



(12)发明专利

(10)授权公告号 CN 104364236 B

(45)授权公告日 2018.01.16

(21)申请号 201380028564.X

C07D 231/16(2006.01)

(22)申请日 2013.05.06

(56)对比文件

(65)同一申请的已公布的文献号

WO 9212970 A1,1992.08.06,全文.

申请公布号 CN 104364236 A

WO 02058086 A1,2002.07.25,全文.

(43)申请公布日 2015.02.18

WO 2011162397 A1,2011.12.29,全文.

(30)优先权数据

12167280.2 2012.05.09 EP

12197381.2 2012.12.16 EP

(85)PCT国际申请进入国家阶段日

2014.11.28

(86)PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2013/059410 2013.05.06

(87)PCT国际申请的公布数据

WO2013/167544 EN 2013.11.14

(73)专利权人 拜尔农作物科学股份公司

地址 德国蒙海姆

(72)发明人 C·杜波斯特 吉恩-皮尔·沃斯

皮尔-伊夫斯·科奎罗恩

S·米其林 M·埃斯-塞伊德

P·瓦斯内尔

U·沃肯道夫-诺伊曼 D·伯尼尔

L·卡勒斯 S·布鲁奈特

H·拉切斯 P·格尼克斯

(74)专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司

11285

代理人 王媛 钟守期

(51)Int.Cl.

C07D 231/14(2006.01)

I. B. Abdrakhmanov,等,REACTION OF 2-(1-METHYL-2-BUTENYL)ANILINES WITH POLYPHOSPHORIC ACID.《BULLETIN OF THE ACADEMY OF SCIENCES OF THE USSR DIVISION OF CHEMICAL SCIENCES》.1985,第34卷(第4期),第760-763页.

LOUISF. FIESER,等.16,20-Dimethylcholanthren.《J.AM.CHEM.SOC》.1935,第57卷(第7期),第1377-1378页.

Charles A.Panetta,等.Tetracyano-4,7-indanoquinodimethanes:The First TCNQs with an Indan Nucleus.《Synthesis》.1997,第1085-1090页.

Hiroshi Tanida,等.Relative Reactivities of some Benzocyclenes in Aromatic Nitration and Electrophilic Slide-Chain Reaction. A Remarkable Effect of the Bicyclo[2.2.1]heptene System.《J.AM.CHEM.SOC》.1965,第87卷(第21期),第4794-4804页. (续)

审查员 王沙沙

权利要求书3页 说明书119页

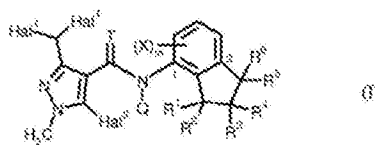
(54)发明名称

5-卤代吡唑二氢茛基甲酰胺

(57)摘要

本发明涉及一种新的1-甲基-3-二卤代甲基-5-卤代吡唑(硫代)二氢茛基甲酰胺、制备这些化合物的方法、包含这些化合物的组合物,及其作为生物活性化合物的用途,特别是在作物保

护和材料保护中用于防治有害微生物的用途。



①

[接上页]

(56)对比文件

Walid Zeghida,等.Concise Synthesis of 2-Amino-4(3H)-quinazolinones from Simple (Hetero)aromatic Amines.《J. Org. Chem.》.2008,第73卷(第6期),第2473-2475页.

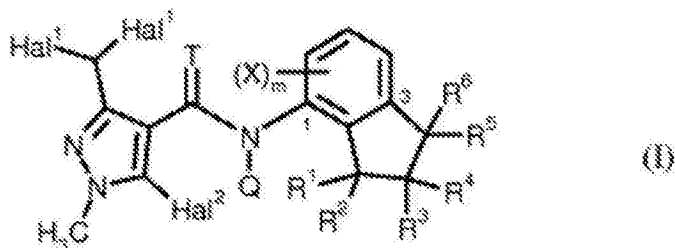
HANS STERNERUP.Studies on the Possible Effects of Adsorption on the product Distribution of Organic Electrode Reactions.IV.Anodic Acetoxylation of 2-Methylindan,2,2-Dimethylindan,5,6-Dimethoxy-2-methylindan and Neopentylbenzene.《Acta Chemica

Scandinavica》.1974,第28B卷第969-980页.

A. G. Mustafin,等.CYCLIZATION OF 2-(1-ALKYL-2-ALKENYL)ANILINES IN POLYPHOSPHORIC ACID.《BULLETIN OF THE ACADEMY OF SCIENCES OF THE USSR;DIVISION OF CHEMICAL SCIENCES》.1990,第39卷(第19期),第2551-2553页.

Gerardus B. M. Kostermans,等.Intermediate Formation of [4] Metacyclophane on Flash Vacuum Thermolysis.《J.Org.Chem.》.1988,第53卷(第19期),第4533页.

1. 式 (I) 的 1-甲基-3-二卤代甲基-5-卤代吡唑二氢茚基甲酰胺



其中,

Hal¹代表氟;

Hal²代表氯、溴或氟;

T代表氧原子;

Q代表氢;

X代表氟、氯、溴、碘、甲基或环丙基;

m代表0或1;

R¹和R²彼此独立地代表氢、甲基;

R³代表氢、甲基、乙基、异丙基、环戊基、苄基;

R⁴代表氢、甲基、乙基;

R⁵代表甲基、乙基、异丙基、异丁基、叔丁基、2,2-二甲基丙基;

R⁶代表氢、甲基、乙基;

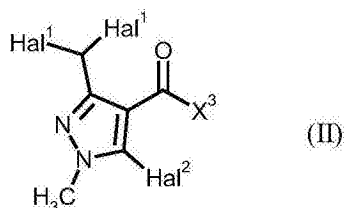
条件是当R²、R³和R⁴同时代表氢时,R¹、R⁵和R⁶不同时代表甲基;

R³和R⁴可以和它们所连接的碳原子一起形成环戊基;

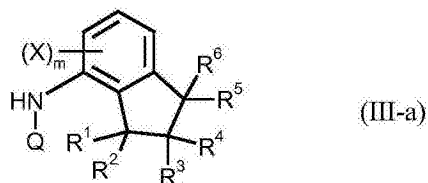
R⁴和R⁵可以和它们所连接的碳原子一起形成环戊基;

R⁵和R⁶可以和它们所连接的碳原子一起形成被氯任选取代的环丙基、环戊基、环己基;或可以形成基团=N-O-R^c,其中R^c代表甲基、乙基、丙基、丁基。

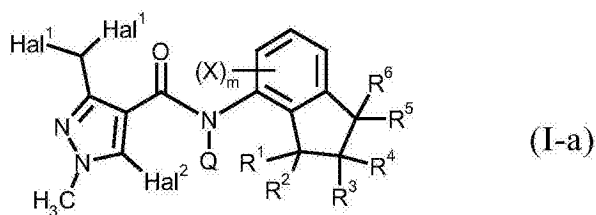
2. 权利要求1的式 (I) 的化合物的制备方法,其特征在于,在方法 (a) 中,式 (II) 的羰基卤化物或酸与式 (III-a) 的胺反应,获得式 (I-a) 的化合物,如果合适在偶联剂的存在下,如果合适在酸粘合剂的存在下,以及如果合适在稀释剂的存在下,



其中, Hal¹和Hal²具有权利要求1中限定的含义, X³代表卤素或羟基,

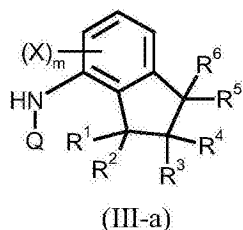


其中, Q、X、m、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵和R⁶具有权利要求1中限定的含义,



其中, Hal¹、Hal²、Q、X、m、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵和R⁶具有权利要求1中限定的含义。

3. 式 (III-a) 的化合物,



其中,

Q代表氢;

X代表卤素、环丙基;

m代表0或1;

R¹和R²彼此独立地代表氢、甲基;

R³代表氢、乙基、异丙基、苄基、环戊基;

R⁴代表氢、乙基;

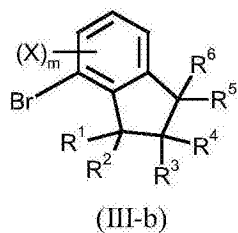
R⁵代表甲基、异丙基、异丁基、叔丁基、二甲基丙基;

R⁶代表氢;

R³和R⁴可以和它们所连接的碳原子一起形成环戊基;

R⁵和R⁶可以和它们所连接的碳原子一起形成未取代的环丙基或被氯取代的环丙基或基团=N-O-R^c, 其中R^c代表甲基、乙基、丙基或丁基。

4. 式 (III-b) 的化合物,



其中

m代表0;

R¹和R²彼此独立地代表氢、甲基;

R³代表氢、甲基、乙基、异丙基、苄基、环戊基;

R⁴代表氢、甲基;

R⁵代表异丙基、异丁基;

R⁶代表氢、甲基;

R⁵和R⁶可以和它们所连接的碳原子一起形成基团=N-O-R^c, 其中R^c代表甲基、乙基、丙基或丁基。

5. 用于防治植物病原体有害真菌的方法, 其特征在于, 权利要求1的式(I)的化合物被施用于植物病原体有害真菌和/或它们的栖息地。

6. 用于防治植物病原体有害真菌的组合物, 其特征在于, 除填充剂和/或表面活性剂外, 该组合物还含有至少一种权利要求1的式(I)的化合物。

7. 权利要求6的组合物, 包含至少一种选自杀虫剂、引诱剂、消毒剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生长调节剂、除草剂、肥料、安全剂和/或化学信息素的其他活性成分。

8. 权利要求1的式(I)的化合物或权利要求7的组合物用于防治植物病原体有害真菌的用途。

9. 制备用于防治植物病原体有害真菌的组合物方法, 其特征在于, 将权利要求1的式(I)的化合物与填充剂和/或表面活性剂进行混合。

10. 权利要求1的式(I)的化合物或权利要求7的组合物用于处理转基因植物的用途。

11. 权利要求1的式(I)的化合物或权利要求7的组合物用于处理种子或转基因植物的种子的用途。

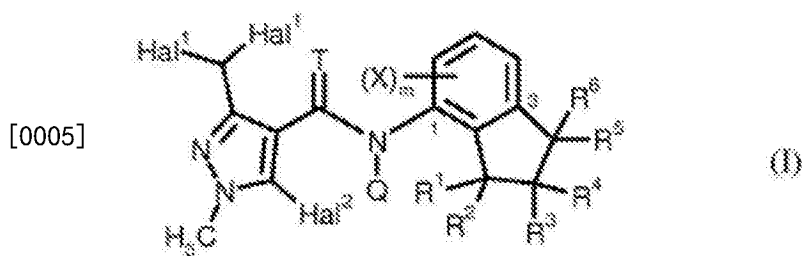
5-卤代吡唑二氢茛基甲酰胺

[0001] 本发明涉及一种新的1-甲基-3-二卤代甲基-5-卤代吡唑(硫代)二氢茛基甲酰胺、制备这些化合物的方法、包含这些化合物的组合物,及其作为生物活性化合物的用途,特别是在作物保护和材料保护中用于防治有害微生物的用途。

[0002] 已知某些吡唑二氢茛基甲酰胺具有杀菌特性(例如WO 92/12970、EP-A 0 199 822、EP-A 0 276 177、JP-A 62-096472、JP-A 05-310512、JP-A 01-313402、WO 02/059086、WO 2004/103975和J.Org.Chem.1995,60,1626-1631)。

[0003] 由于对现代活性成分例如杀真菌剂在生态上和经济上的要求不断增加,例如在活性谱、毒性、选择性、施用率、残留物的形成和良好的制备等方面,且还可能例如在抗性方面出现其他问题,因而需要不断开发新的杀真菌剂组合物,其至少在某些方面优于已知组合物。

[0004] 本发明提供一种新的式(I)的1-甲基-3-二卤代甲基-5-卤代吡唑(硫代)二氢茛基甲酰胺



[0006] 其中,

[0007] Hal¹代表氯或氟;

[0008] Hal²代表氯、溴或氟;

[0009] T代表氧原子或硫原子;

[0010] Q代表氢、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、卤代-C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基;

[0011] X代表卤素、硝基、氰基、C₁-C₁₂-烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基;C₁-C₆-烷氧基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷氧基;C₁-C₆-烷基硫烷基(alkylsulfanyl);具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基硫烷基;C₁-C₆-烷基磺酰基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基磺酰基;C₂-C₁₂-烯基;C₂-C₁₂-炔基;C₃-C₇-环烷基;苯基;三(C₁-C₈)-烷基甲硅烷基(alkylsilyl);三(C₁-C₈)-烷基甲硅烷基-C₁-C₈烷基;

[0012] m代表0、1、2或3;

[0013] R¹、R²、R³、R⁴、R⁵和R⁶彼此独立地代表氢、卤素;硝基;氰基;羟基;氨基;硫烷基(sulfanyl)、C₁-C₁₆-烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基;C₃-C₈-环烷基;(C₃-C₈-环烷基)-C₁-C₈-烷基;(C₃-C₈-环烷基)-C₃-C₈-环烷基;C₂-C₈-烯基;C₂-C₈-炔基;C₂-C₈-烯基-C₁-C₁₆-烷基;C₂-C₈-炔基-C₁-C₁₆-烷基;C₁-C₁₆-烷氧基;C₃-C₈-环烷氧基;(C₃-C₈-环烷基)-C₁-C₈-烷氧基;C₁-C₈-烷基硫烷基;C₃-C₈-环烷基硫烷基(cycloalkylsulfanyl);(C₃-C₈-

环烷基)-C₁-C₈-烷基硫烷基; C₂-C₈-烯基氧基; C₃-C₈-炔基氧基; 任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₈-烷氧基; 任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₈-烷基硫烷基; 任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳氧基; 任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基硫烷基(arylsulfanyl); (C₃-C₈-环烷基)-C₂-C₈-烯基; (C₃-C₈-环烷基)-C₂-C₈-炔基; 三(C₁-C₈)-烷基甲硅烷基; 三(C₁-C₈)-烷基甲硅烷基-C₁-C₈-烷基; 任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₈-烷基; 任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₂-C₈-烯基; 任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₂-C₈-炔基; C₁-C₈-烷基氨基(alkylamino); 二-C₁-C₈-烷基氨基; 任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基氨基(arylamino); C₁-C₈-烷基羰基; C₁-C₈-烷基羰基氧基; C₁-C₈-烷基羰基氨基; C₁-C₈-烷氧基羰基; C₁-C₈-烷氧基羰基氧基; C₁-C₈-烷基氨基甲酰基; 二-C₁-C₈-烷基氨基甲酰基; C₁-C₈-烷基氨基羰基氧基; 二-C₁-C₈-烷基氨基羰基氧基; N-(C₁-C₈烷基)羟基氨基甲酰基; C₁-C₈-烷氧基氨基甲酰基; N-(C₁-C₈烷基) C₁-C₈-烷氧基氨基甲酰基; 任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的C₁-C₈-芳基烷基氨基; (C₁-C₈-烷氧基亚氨基)-C₁-C₈-烷基; (C₂-C₈-环烷氧基亚氨基)-C₁-C₈-烷基; C₁-C₈-烷基亚氨氧基; C₁-C₈-烷基亚氨氧基-C₁-C₈-烷基; 其各自被任选取代;

[0014] 条件是当R²、R³和R⁴同时代表氢时, R¹、R⁵和R⁶不同时代表甲基。

[0015] R¹和R²可以和它们所连接的碳原子一起形成C₃-C₈-环烷基; C₃-C₈-环烯基或饱和的5、6或7元杂环; 其各自被任选取代; 或可以代表基团=C(Y¹)Y²或基团=N-O-R^c;

[0016] R³和R⁴可以和它们所连接的碳原子一起形成C₃-C₈-环烷基; C₃-C₈-环烯基或饱和的5、6或7元杂环; 其各自被任选取代; 或可以代表基团=C(Y¹)Y²或基团=N-O-R^c;

[0017] R⁴和R⁵可以和它们所连接的碳原子一起形成C₃-C₈-环烷基; C₃-C₈-环烯基或饱和的5、6或7元杂环; 其各自被任选取代; 或可以代表基团=C(Y¹)Y²或基团=N-O-R^c;

[0018] R⁵和R⁶可以和它们所连接的碳原子一起形成C₃-C₈-环烷基; C₃-C₈-环烯基或饱和的5、6或7元杂环; 其各自被任选取代; 或可以代表基团=C(Y¹)Y²或基团=N-O-R^c;

[0019] R¹和R³或者R³和R⁵可以和它们所连接的碳原子一起形成C₃-C₈-环烷基; C₃-C₈-环烯基或饱和的5、6或7元杂环; 其各自被任选取代;

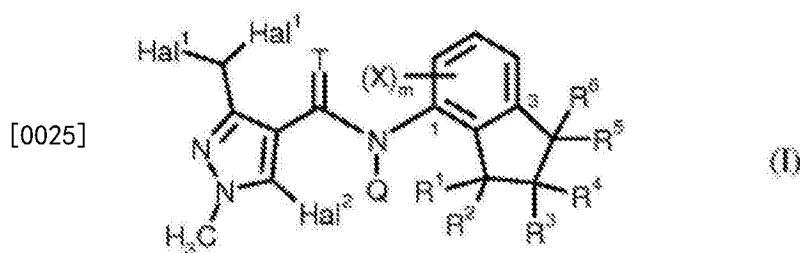
[0020] R^b代表卤素; 硝基、氰基、C₁-C₁₂-烷基; 具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基; C₁-C₆-烷氧基; 具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷氧基; C₁-C₆-烷基硫烷基; 具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基硫烷基; C₁-C₆-烷基磺酰基; 具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基磺酰基; C₂-C₁₂-烯基; C₂-C₁₂-炔基; C₃-C₇-环烷基; 苯基; 三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基; 三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基-C₁-C₈-烷基;

[0021] Y¹和Y²彼此独立地代表氢、卤素、C₁-C₁₂-烷基; 具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基; C₁-C₈-烷基硫烷基; 苯基; 各自被任选取代; 或者

[0022] Y¹和Y²可以和它们所连接的碳原子一起形成C₃-C₈-环烷基或C₃-C₈-环烯基或饱和的5、6或7元杂环; 其各自被任选取代;

[0023] R^c代表C₁-C₁₆-烷基; 具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基; C₃-C₈-环烷基; (C₃-C₈-环烷基)-C₁-C₈-烷基; (C₃-C₈-环烷基)-C₃-C₈-环烷基; C₂-C₈-烯基-C₁-C₁₆-烷基; C₂-C₈-炔基-C₁-C₁₆-烷基; 任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₈-烷基; 各自被任选取代。

[0024] 本发明现提供一种新的式(I)的1-甲基-3-二卤代甲基-5-卤代吡唑(硫代)二氢茛基甲酰胺



[0026] 其中,

[0027] Hal¹代表氯或氟;

[0028] Hal²代表氯或氟;

[0029] T代表氧原子或硫原子,

[0030] Q代表氢、C₁-C₆-烷基磺酰基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、卤代-C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基;

[0031] X代表卤素、硝基、氰基、C₁-C₁₂-烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基;C₁-C₆-烷氧基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷氧基;C₁-C₆-烷基硫烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基硫烷基;C₁-C₆-烷基磺酰基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基磺酰基;C₂-C₁₂-烯基;C₂-C₁₂-炔基;C₃-C₇-环烷基;苯基;三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基;三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基-C₁-C₈-烷基;

[0032] m代表0、1、2或3;

[0033] R¹、R²、R³、R⁴、R⁵和R⁶彼此独立地代表氢、卤素;硝基;氰基;羟基;氨基;硫烷基、C₁-C₁₆-烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基;C₃-C₈-环烷基;(C₃-C₈-环烷基)-C₁-C₈-烷基;(C₃-C₈-环烷基)-C₃-C₈-环烷基;C₂-C₈-烯基;C₂-C₈-炔基;C₂-C₈-烯基-C₁-C₁₆-烷基;C₂-C₈-炔基-C₁-C₁₆-烷基、C₁-C₁₆-烷氧基;C₃-C₈-环烷氧基;(C₃-C₈-环烷基)-C₁-C₈-烷氧基;C₁-C₈-烷基硫烷基;C₃-C₈-环烷基硫烷基;(C₃-C₈-环烷基)-C₁-C₈-烷基硫烷基;C₂-C₈-烯基氧基;C₃-C₈-炔基氧基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₈-烷氧基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₈-烷基硫烷基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基氧基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基硫烷基;(C₃-C₈-环烷基)-C₂-C₈-烯基;(C₃-C₈-环烷基)-C₂-C₈-炔基;三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基;三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基-C₁-C₈-烷基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₈-烷基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₂-C₈-烯基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₂-C₈-炔基;C₁-C₈-烷基氨基;二-C₁-C₈-烷基氨基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基氨基;C₁-C₈-烷基羰基;C₁-C₈-烷基羰基氧基;C₁-C₈-烷基羰基氨基;C₁-C₈-烷氧基羰基;C₁-C₈-烷氧基羰基氧基;C₁-C₈-烷基氨基甲酰基;二-C₁-C₈-烷基氨基甲酰基;C₁-C₈-烷基氨基羰基氧基;二-C₁-C₈-烷基氨基羰基氧基;N-(C₁-C₈-烷基)羟基氨基甲酰基;C₁-C₈-烷氧基氨基甲酰基;N-(C₁-C₈-烷基)-C₁-C₈-烷氧基氨基甲酰基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的C₁-C₈-芳基烷基氨基;(C₁-C₈-烷氧基亚氨基)-C₁-C₈-烷基;(C₂-C₈-环烷氧基亚氨基)-C₁-C₈-烷基;C₁-C₈-烷基亚氨基氧基;C₁-C₈-烷基亚氨基氧基-C₁-C₈-烷基;其各自被任选取代;

[0034] 条件是当 R^2 、 R^3 和 R^4 同时代表氢时, R^1 、 R^5 和 R^6 不同时代表甲基。

[0035] R^1 和 R^2 可以和它们所连接的碳原子一起形成 C_3 - C_8 环烷基; C_3 - C_8 环烯基或饱和的5、6或7元杂环;其各自可被任选取代;或可以代表基团 $=C(Y^1)Y^2$ 或基团 $=N-O-R^c$;

[0036] R^3 和 R^4 可以和它们所连接的碳原子一起形成 C_3 - C_8 -环烷基; C_3 - C_8 -环烯基或饱和的5、6或7元杂环;其各自可被任选取代;或可以代表基团 $=C(Y^1)Y^2$ 或基团 $=N-O-R^c$;

[0037] R^5 和 R^6 可以和它们所连接的碳原子一起形成 C_3 - C_8 -环烷基; C_3 - C_8 -环烯基或饱和的5、6或7元杂环;其各自可被任选取代;或可以代表基团 $=C(Y^1)Y^2$ 或基团 $=N-O-R^c$;

[0038] R^1 和 R^3 或者 R^3 和 R^5 可以和它们所连接的碳原子一起形成 C_3 - C_8 -环烷基; C_3 - C_8 -环烯基或饱和的5、6或7元杂环;其各自可被任选取代;

[0039] R^b 代表卤素;硝基、氰基、 C_1 - C_{12} 烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷基; C_1 - C_6 -烷氧基;具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷氧基; C_1 - C_6 -烷基硫烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷基硫烷基; C_1 - C_6 -烷基磺酰基;具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基; C_2 - C_{12} -烯基; C_2 - C_{12} -炔基; C_3 - C_7 环烷基;苯基;三(C_1 - C_8)烷基甲硅烷基;三(C_1 - C_8)烷基甲硅烷基- C_1 - C_8 烷基;

[0040] Y^1 和 Y^2 彼此独立地代表氢、卤素、 C_1 - C_{12} -烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷基; C_1 - C_8 -烷基硫烷基;苯基;各自被任选取代;或 Y^1 和 Y^2 可以和它们所连接的碳原子一起形成 C_3 - C_8 -环烷基或 C_3 - C_8 -环烯基或饱和的5、6或7元杂环;其各自可被任选取代;

[0041] R^c 代表 C_1 - C_{16} -烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷基; C_3 - C_8 -环烷基;(C₃-C₈-环烷基)- C_1 - C_8 -烷基;(C₃-C₈-环烷基)- C_3 - C_8 -环烷基; C_2 - C_8 -烯基- C_1 - C_{16} -烷基; C_2 - C_8 -炔基- C_1 - C_{16} -烷基;任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- C_1 - C_8 -烷基;其各自被任选取代。

[0042] 在一个优选实施方案中描述了如上所述的式(I)的1-甲基-3-二卤代甲基-5-卤代吡唑(硫代)二氢茚基甲酰胺,其中

[0043] Hal^1 代表氯或氟;

[0044] Hal^2 代表氯、溴或氟;

[0045] T代表氧原子或硫原子;

[0046] Q代表氢、 C_1 - C_4 -烷基磺酰基、 C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_4 -卤代烷基磺酰基、各自具有1至9个氟、氯和/或溴原子的卤代- C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基;

[0047] X代表氟、氯、碘、甲基、环丙基或三氟甲基;

[0048] m代表0、1或2;

[0049] R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 彼此独立地代表氢、卤素;氰基; C_1 - C_{16} -烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷基; C_3 - C_8 -环烷基;(C₃-C₈-环烷基)- C_1 - C_8 -烷基;(C₃-C₈-环烷基)- C_3 - C_8 -环烷基; C_2 - C_8 -烯基; C_2 - C_8 -炔基; C_2 - C_8 -烯基- C_1 - C_{16} -烷基; C_2 - C_8 -炔基- C_1 - C_{16} -烷基; C_1 - C_{16} -烷氧基; C_3 - C_8 -环烷氧基;(C₃-C₈-环烷基)- C_1 - C_8 -烷基氧基; C_1 - C_8 -烷基硫烷基; C_3 - C_8 -环烷基硫烷基;(C₃-C₈-环烷基)- C_1 - C_8 -烷基硫烷基; C_2 - C_8 -烯基氧基; C_3 - C_8 -炔基氧基;任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- C_1 - C_8 -烷氧基;任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- C_1 - C_8 -烷基硫烷基;任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳氧基;任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基硫烷基;(C₃-C₈-环烷基)- C_2 - C_8 -烯基;(C₃-C₈-环烷基)- C_2 - C_8 -炔基;三(C_1 - C_8)烷基甲硅烷基;三(C_1 - C_8)烷基甲硅烷

基-C₁-C₈-烷基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₈-烷基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₂-C₈-烯基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₂-C₈-炔基;其各自被任选取代;

[0050] 条件是当R²、R³和R⁴同时代表氢时,R¹、R⁵和R⁶不同时代表甲基;

[0051] R¹和R²可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的C₃-C₈-环烷基;或可以形成基团=C(Y¹)Y²(其中,Y¹和Y²彼此独立地代表卤素、C₁-C₁₂-烷基、具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基;或可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基)或基团=N-O-R^c(其中R^c代表C₁-C₁₂-烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基;C₃-C₆-环烷基;(C₃-C₆-环烷基)-C₁-C₆-烷基;(C₃-C₆-环烷基)-C₃-C₆-环烷基;C₂-C₆-烯基-C₁-C₁₂-烷基;C₂-C₆-炔基-C₁-C₁₂-烷基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₆-烷基;其各自被任选取代);

[0052] R³和R⁴可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的C₃-C₈-环烷基;或可以形成基团=C(Y¹)Y²(其中,Y¹和Y²彼此独立地代表卤素、C₁-C₁₂-烷基、具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基;或可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基)或基团=N-O-R^c(其中R^c代表C₁-C₁₂-烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基;C₃-C₆-环烷基;(C₃-C₆-环烷基)-C₁-C₆-烷基;(C₃-C₆-环烷基)-C₃-C₆-环烷基;C₂-C₆-烯基-C₁-C₁₂-烷基;C₂-C₆-炔基-C₁-C₁₂-烷基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₆-烷基;其各自被任选取代);

[0053] R⁴和R⁵可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的C₃-C₈-环烷基;或可以形成基团=C(Y¹)Y²(其中,Y¹和Y²彼此独立地代表卤素、C₁-C₁₂-烷基、具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基;或可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基)或基团=N-O-R^c(其中R^c代表C₁-C₁₂-烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基;C₃-C₆-环烷基;(C₃-C₆-环烷基)-C₁-C₆-烷基;(C₃-C₆-环烷基)-C₃-C₆-环烷基;C₂-C₆-烯基-C₁-C₁₂-烷基;C₂-C₆-炔基-C₁-C₁₂-烷基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₆-烷基;其各自被任选取代);

[0054] R⁵和R⁶可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的C₃-C₈-环烷基;或可以形成基团=C(Y¹)Y²(其中,Y¹和Y²彼此独立地代表卤素、C₁-C₁₂-烷基、具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基;或可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基)或基团=N-O-R^c(其中R^c代表C₁-C₁₂-烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基;C₃-C₆-环烷基;(C₃-C₆-环烷基)-C₁-C₆-烷基;(C₃-C₆-环烷基)-C₃-C₆-环烷基;C₂-C₆-烯基-C₁-C₁₂-烷基;C₂-C₆-炔基-C₁-C₁₂-烷基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₆-烷基;其各自被任选取代);

[0055] R¹和R³或R³和R⁵可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的C₃-C₈-环烷基;

[0056] R^b代表卤素;硝基、氰基、C₁-C₈-烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₄-卤代烷基;C₁-C₆-烷氧基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₄-卤代烷氧基;C₁-C₆-烷基硫烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₄-卤代烷基硫烷基;C₁-C₆-烷基磺酰基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₄-卤代烷基磺酰基;C₂-C₈-烯基;C₂-C₈-炔基;C₃-C₆-环烷基;苯基;三(C₁-C₆)烷基甲硅烷基;三(C₁-C₆)烷基甲硅烷基-C₁-C₆-烷基。

[0057] 在一个优选实施方案中描述了如上所述的式(I)的1-甲基-3-二卤代甲基-5-卤代

吡唑(硫代)二氢茛基甲酰胺,其中

[0058] Hal^1 代表氯或氟;

[0059] Hal^2 代表氯或氟;

[0060] T代表氧原子;

[0061] Q代表氢、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基磺酰基、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基磺酰基、各自具有1至9个氟、氯和/或溴原子的卤代- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基;

[0062] X代表氟、氯、甲基或三氟甲基;

[0063] m代表0、1或2;

[0064] R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 彼此独立地代表氢、卤素;氰基; $\text{C}_1\text{-C}_{16}$ -烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基;(C₃-C₈-环烷基)- $\text{C}_1\text{-C}_8$ -烷基;(C₃-C₈-环烷基)- $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基; $\text{C}_2\text{-C}_8$ -烯基; $\text{C}_2\text{-C}_8$ -炔基; $\text{C}_2\text{-C}_8$ -烯基- $\text{C}_1\text{-C}_{16}$ -烷基; $\text{C}_2\text{-C}_8$ -炔基- $\text{C}_1\text{-C}_{16}$ -烷基; $\text{C}_1\text{-C}_{16}$ -烷氧基; $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷氧基;(C₃-C₈-环烷基)- $\text{C}_1\text{-C}_8$ -烷氧基; $\text{C}_1\text{-C}_8$ -烷基硫烷基; $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基硫烷基;(C₃-C₈-环烷基)- $\text{C}_1\text{-C}_8$ -烷基硫烷基; $\text{C}_2\text{-C}_8$ -烯基氧基; $\text{C}_3\text{-C}_8$ -炔基氧基;任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- $\text{C}_1\text{-C}_8$ -烷氧基;任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- $\text{C}_1\text{-C}_8$ -烷基硫烷基;任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳氧基;任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基硫烷基;(C₃-C₈-环烷基)- $\text{C}_2\text{-C}_8$ -烯基;(C₃-C₈-环烷基)- $\text{C}_2\text{-C}_8$ -炔基;三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基;三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基- $\text{C}_1\text{-C}_8$ -烷基;任选被至多6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- $\text{C}_1\text{-C}_8$ -烷基、任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- $\text{C}_2\text{-C}_8$ -烯基;任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- $\text{C}_2\text{-C}_8$ -炔基;其各自被任选取代。

[0065] 条件是当 R^2 、 R^3 和 R^4 同时代表氢时, R^1 、 R^5 和 R^6 不同时代表甲基;

[0066] R^1 和 R^2 可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的 $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基;或可以形成基团 $=\text{C}(\text{Y}^1)\text{Y}^2$ (其中, Y^1 和 Y^2 彼此独立地代表卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ -烷基、具有1至9个相同或不同卤原子的 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基;或可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基)或基团 $=\text{N-O-R}^c$ (其中 R^c 代表 $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ -烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基; $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基;(C₃-C₆-环烷基)- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基;(C₃-C₆-环烷基)- $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基; $\text{C}_2\text{-C}_6$ -烯基- $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ -烷基; $\text{C}_2\text{-C}_6$ -炔基- $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ -烷基;任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基;其各自可被任选取代);

[0067] R^3 和 R^4 可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的 $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基;或可以形成基团 $=\text{C}(\text{Y}^1)\text{Y}^2$ (其中, Y^1 和 Y^2 彼此独立地代表卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ -烷基、具有1至9个相同或不同卤原子的 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基;或可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基)或基团 $=\text{N-O-R}^c$ (其中 R^c 代表 $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ -烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基; $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基;(C₃-C₆-环烷基)- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基;(C₃-C₆-环烷基)- $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基; $\text{C}_2\text{-C}_6$ -烯基- $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ -烷基; $\text{C}_2\text{-C}_6$ -炔基- $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ -烷基;任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷基;其各自可被任选取代);

[0068] R^5 和 R^6 可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的 $\text{C}_3\text{-C}_8$ -环烷基;或可以形成基团 $=\text{C}(\text{Y}^1)\text{Y}^2$ (其中, Y^1 和 Y^2 彼此独立地代表卤素、 $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ -烷基、具有1至9个相同或不同卤原子的 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -卤代烷基;或可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的环丙基、环戊基、环丁基、环己基)或基团 $=\text{N-O-R}^c$ (其中 R^c 代表 $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ -烷基;具有1至9个相同或不同卤原

子的C₁-C₆-卤代烷基;C₃-C₆-环烷基;(C₃-C₆-环烷基)-C₁-C₆-烷基;(C₃-C₆-环烷基)-C₃-C₆-环烷基;C₂-C₆-烯基-C₁-C₁₂-烷基;C₂-C₆-炔基-C₁-C₁₂-烷基;任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₆-烷基;其各自可被任选取代);

[0069] R¹和R³或R³和R⁵可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的C₃-C₈-环烷基;

[0070] R^b代表卤素;硝基、氰基、C₁-C₈-烷基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₄-卤代烷基;C₁-C₆-烷氧基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₄-卤代烷氧基;C₁-C₆-烷硫基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₄-卤代烷基硫烷基;C₁-C₆-烷基磺酰基;具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₄-卤代烷基磺酰基;C₂-C₈-烯基;C₂-C₈-炔基;C₃-C₆-环烷基;苯基;三(C₁-C₆)烷基甲硅烷基;三(C₁-C₆)烷基甲硅烷基-C₁-C₆-烷基。

[0071] 在一个非常优选的实施方案中描述了式(I)的1-甲基-3-二卤代甲基-5-卤代吡唑(硫代)二氢茛基甲酰胺,其中

[0072] Ha1¹代表氯或氟;

[0073] Ha1²代表氯、溴或氟;

[0074] T代表氧原子或硫原子;

[0075] Q代表氢;

[0076] X代表氟、氯、溴、碘、甲基或环丙基;

[0077] m代表0或1;

[0078] R¹、R²、R³、R⁴、R⁵和R⁶彼此独立地非常特别地优选代表氢、甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、2,2-二甲基丙基;条件是当R²、R³和R⁴同时代表氢时,R¹、R⁵和R⁶不同时代表甲基;

[0079] 条件是当R²、R³和R⁴同时代表氢时,R¹、R⁵和R⁶不同时代表甲基;

[0080] R¹和R²可以和它们所连接的碳原子一起形成被氯任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基;或可形成基团=C(Y¹)Y²(其中,Y¹和Y²彼此独立地代表氟、氯、溴、甲基、乙基、丙基、异丙基)或基团=N-O-R^c(其中R^c代表甲基、乙基、丙基、丁基);

[0081] R³和R⁴可以和它们所连接的碳原子一起优选形成被氯任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基;或可以形成基团=C(Y¹)Y²(其中,Y¹和Y²彼此独立地代表氟、氯、溴、甲基、乙基、丙基、异丙基)或基团=N-O-R^c(其中R^c代表甲基、乙基、丙基、丁基);

[0082] R⁴和R⁵可以和它们所连接的碳原子一起形成被氯任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基;

[0083] R⁵和R⁶可以和它们所连接的碳原子一起形成被氯任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基;或可以形成基团=C(Y¹)Y²(其中,Y¹和Y²彼此独立地代表氟、氯、溴、甲基、乙基、丙基、异丙基)或基团=N-O-R^c(其中R^c代表甲基、乙基、丙基、丁基)。

[0084] 式(I)提供了本发明的1-甲基-3-二卤代甲基-5-卤代吡唑(硫代)二氢茛基甲酰胺的通用定义。下文给出了上下文所示的式中的优选基团的定义。这些定义适用于式(I)的最终产物和所有中间产物。

[0085] Ha1¹优选代表氯。

[0086] Ha1¹还优选代表氟。

[0087] Ha1²优选代表氯。

[0088] Ha1²还优选代表氟。

- [0089] T优选代表氧原子，
- [0090] T优选代表硫原子，
- [0091] Q优选代表氢、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、各自具有1至9个氟、氯和/或溴原子的卤代-C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基；
- [0092] Q特别优选代表氢、甲基磺酰基、乙基磺酰基、正丙基磺酰基、异丙基磺酰基、正丁基磺酰基、异丁基磺酰基、仲丁基磺酰基、叔丁基磺酰基、甲氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基甲基、乙氧基乙基、三氟甲基磺酰基、三氟甲氧基甲基。
- [0093] Q非常特别优选代表氢。
- [0094] X优选代表氟、氯、溴、碘、甲基、三氟甲基或环丙基。
- [0095] X优选代表氟、氯、溴、碘、甲基或环丙基。
- [0096] X优选代表氟、氯、甲基或三氟甲基。
- [0097] X特别优选代表氟，其中氟特别优选位于二氢茚基基团的4、5或6位，非常特别优选位于4位或6位，尤其是4位。
- [0098] X还特别优选代表氯，其中氯特别优选位于二氢茚基基团的4位或5位，尤其是位于4位。
- [0099] X还特别优选代表溴，其中溴特别优选位于二氢茚基基团的4位或5位，尤其是位于4位。
- [0100] X还特别优选代表碘，其中碘特别优选位于二氢茚基基团的4位或5位，尤其是位于4位。
- [0101] X还特别优选代表甲基，其中甲基特别优选位于二氢茚基基团的4位或5位。
- [0102] X还特别优选代表三氟甲基，其中三氟甲基特别优选位于二氢茚基基团的4位或5位。
- [0103] X还特别优选代表环丙基，其中环丙基特别优选位于二氢茚基基团的4位或5位。
- [0104] m代表0、1或2。
- [0105] m特别优选代表0或1。
- [0106] m非常特别优选代表0。
- [0107] R¹、R²、R³、R⁴、R⁵和R⁶彼此独立地优选代表氢、卤素；氰基；C₁-C₁₆-烷基；具有1至9个相同或不同卤原子的C₁-C₆-卤代烷基；C₃-C₈-环烷基；(C₃-C₈-环烷基)-C₁-C₈-烷基；(C₃-C₈-环烷基)-C₃-C₈-环烷基；C₂-C₈-烯基；C₂-C₈-炔基；C₂-C₈-烯基-C₁-C₁₆-烷基；C₂-C₈-炔基-C₁-C₁₆-烷基；C₁-C₁₆-烷氧基；C₃-C₈-环烷氧基；(C₃-C₈-环烷基)-C₁-C₈-烷氧基；C₁-C₈-烷基硫烷基；C₃-C₈-环烷基硫烷基；(C₃-C₈-环烷基)-C₁-C₈-烷基硫烷基；C₂-C₈-烯基氧基；C₃-C₈-炔基氧基；任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₈-烷氧基；任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₈-烷基硫烷基；任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳氧基；任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基硫烷基；(C₃-C₈-环烷基)-C₂-C₈-烯基；(C₃-C₈-环烷基)-C₂-C₈-炔基；三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基；三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基-C₁-C₈-烷基；任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₁-C₈-烷基；任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₂-C₈-烯基；任选被最高达6个相同或不同的R^b基团取代的芳基-C₂-C₈-炔基；其各自被任选取代；条件是当R²、R³和R⁴同时代表氢时，R¹、R⁵和R⁶不同时代表甲基。

[0108] R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 彼此独立地特别优选代表氢、氟、氯、溴、碘； C_1 - C_{12} -烷基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷基； C_3 - C_6 -环烷基；(C_3 - C_6 -环烷基)- C_1 - C_6 -烷基；(C_3 - C_6 -环烷基)- C_1 - C_6 -环烷基； C_1 - C_{12} -烷氧基； C_3 - C_6 -环烷氧基；芳基- C_1 - C_8 -烷基；(C_3 - C_6 -环烷基)- C_1 - C_6 -烷氧基；其各自被任选取代；条件是当 R^2 、 R^3 和 R^4 同时代表氢时， R^1 、 R^5 和 R^6 不同时代表甲基。

[0109] R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 彼此独立地非常特别优选代表氢、甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、苄基；条件是当 R^2 、 R^3 和 R^4 同时代表氢时， R^1 、 R^5 和 R^6 不同时代表甲基。

[0110] R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 彼此独立地非常特别优选代表氢、甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、2,2-二甲基丙基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基、叔丁氧基、苄基；条件是当 R^2 、 R^3 和 R^4 同时代表氢时， R^1 、 R^5 和 R^6 不同时代表甲基。

[0111] R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 彼此独立地非常特别优选代表氢、甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、2,2-二甲基丙基；条件是当 R^2 、 R^3 和 R^4 同时代表氢时， R^1 、 R^5 和 R^6 不同时代表甲基。

[0112] R^1 和 R^2 可以和它们所连接的碳原子一起优选形成任选取代的 C_3 - C_8 -环烷基；或可以形成基团= $C(Y^1)Y^2$ (其中， Y^1 和 Y^2 彼此独立地代表卤素、 C_1 - C_{12} -烷基、具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷基；或可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基)或基团= $N-O-R^c$ (其中 R^c 代表 C_1 - C_{12} -烷基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷基； C_3 - C_6 -环烷基；(C_3 - C_6 -环烷基)- C_1 - C_6 -烷基；(C_3 - C_6 -环烷基)- C_3 - C_6 -环烷基； C_2 - C_6 -烯基- C_1 - C_{12} -烷基； C_2 - C_6 -炔基- C_1 - C_{12} -烷基；任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- C_1 - C_6 -烷基；其各自可被任选取代)。

[0113] R^1 和 R^2 可以和它们所连接的碳原子一起特别优选形成任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基；或可以形成基团= $C(Y^1)Y^2$ (其中， Y^1 和 Y^2 彼此独立地代表氟、氯、溴、甲基、乙基、丙基、异丙基)或基团= $N-O-R^c$ (其中 R^c 代表 C_1 - C_8 -烷基、具有1至9个相同或不同氟、氯、溴原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基； C_3 - C_6 -环烷基；(C_3 - C_6 -环烷基)- C_1 - C_4 -烷基； C_2 - C_6 -烯基- C_1 - C_8 -烷基； C_2 - C_6 -炔基- C_1 - C_8 -烷基；任选被最高达5个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- C_1 - C_4 -烷基；其各自可被任选取代)。

[0114] R^1 和 R^2 可以和它们所连接的碳原子一起特别优选形成被氯任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基；或可以形成基团= $C(Y^1)Y^2$ (其中， Y^1 和 Y^2 彼此独立地代表氟、氯、溴、甲基、乙基、丙基、异丙基)或基团= $N-O-R^c$ (其中 R^c 代表甲基、乙基、丙基、丁基)。

[0115] R^3 和 R^4 可以和它们所连接的碳原子一起优选形成任选取代的 C_3 - C_8 -环烷基；或可以形成基团= $C(Y^1)Y^2$ (其中， Y^1 和 Y^2 彼此独立地代表卤素、 C_1 - C_{12} -烷基、具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷基；或可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基)或基团= $N-O-R^c$ (其中 R^c 代表 C_1 - C_{12} -烷基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷基； C_3 - C_6 -环烷基；(C_3 - C_6 -环烷基)- C_1 - C_6 -烷基；(C_3 - C_6 -环烷基)- C_3 - C_6 -环烷基； C_2 - C_6 -烯基- C_1 - C_{12} -烷基； C_2 - C_6 -炔基- C_1 - C_{12} -烷基；任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- C_1 - C_6 -烷基；其各自可被任选取代)。

[0116] R^3 和 R^4 可以和它们所连接的碳原子一起特别优选形成任选取代的环丙基、环丁基、

环戊基、环己基；或可以形成基团 $=C(Y^1)Y^2$ （其中， Y^1 和 Y^2 彼此独立地代表氟、氯、溴、甲基、乙基、丙基、异丙基）或基团 $=N-O-R^c$ （其中 R^c 代表 C_1-C_8 -烷基；具有1至9个相同或不同氟、氯、溴原子的 C_1-C_4 -卤代烷基； C_3-C_6 -环烷基； $(C_3-C_6$ -环烷基)- C_1-C_4 -烷基； C_2-C_6 -烯基- C_1-C_8 -烷基； C_2-C_6 -炔基- C_1-C_8 -烷基；任选被最高达5个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- C_1-C_4 -烷基；其各自可被任选取代）。

[0117] R^3 和 R^4 可以和它们所连接的碳原子一起特别优选形成被氯任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基；或可以形成基团 $=C(Y^1)Y^2$ （其中， Y^1 和 Y^2 彼此独立地代表氟、氯、溴、甲基、乙基、丙基、异丙基）或基团 $=N-O-R^c$ （其中 R^c 代表甲基、乙基、丙基、丁基）。

[0118] R^5 和 R^6 可以和它们所连接的碳原子一起优选形成任选取代的 C_3-C_8 -环烷基；或可以形成基团 $=C(Y^1)Y^2$ （其中， Y^1 和 Y^2 彼此独立地代表卤素、 C_1-C_{12} -烷基、具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1-C_6 -卤代烷基；或可以和它们所连接的碳原子一起形成任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基）或基团 $=N-O-R^c$ （其中 R^c 代表 C_1-C_{12} -烷基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1-C_6 -卤代烷基； C_3-C_6 -环烷基； $(C_3-C_6$ -环烷基)- C_1-C_6 -烷基； $(C_3-C_6$ -环烷基)- C_3-C_6 -环烷基； C_2-C_6 -烯基- C_1-C_{12} -烷基； C_2-C_6 -炔基- C_1-C_{12} -烷基；任选被最高达6个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- C_1-C_6 -烷基；其各自可被任选取代）。

[0119] R^5 和 R^6 可以和它们所连接的碳原子一起特别优选形成任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基；或可以形成基团 $=C(Y^1)Y^2$ （其中， Y^1 和 Y^2 彼此独立地代表氟、氯、溴、甲基、乙基、丙基、异丙基）或基团 $=N-O-R^c$ （其中 R^c 代表 C_1-C_8 -烷基；具有1至9个相同或不同氟、氯、溴原子的 C_1-C_4 -卤代烷基； C_3-C_6 -环烷基； $(C_3-C_6$ -环烷基)- C_1-C_4 -烷基； C_2-C_6 -烯基- C_1-C_8 -烷基； C_2-C_6 -炔基- C_1-C_8 -烷基；任选被最高达5个相同或不同的 R^b 基团取代的芳基- C_1-C_4 -烷基；其各自可被任选取代）。

[0120] R^5 和 R^6 可以和它们所连接的碳原子一起特别优选形成被氯任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基；或可以形成基团 $=C(Y^1)Y^2$ （其中， Y^1 和 Y^2 彼此独立地代表氟、氯、溴、甲基、乙基、丙基、异丙基）或基团 $=N-O-R^c$ （其中 R^c 代表甲基、乙基、丙基、丁基）。

[0121] R^1 和 R^3 或 R^3 和 R^5 可以和它们所连接的碳原子一起优选形成任选取代的 C_3-C_8 环烷基。

[0122] R^1 和 R^3 或 R^3 和 R^5 可以和它们所连接的碳原子一起特别优选形成任选取代的环丙基、环丁基、环戊基、环己基。

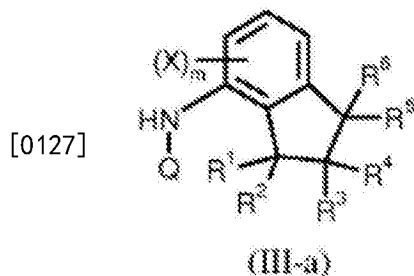
[0123] R^b 优选代表卤素；硝基、氰基、 C_1-C_8 -烷基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1-C_4 -卤代烷基； C_1-C_6 -烷氧基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基； C_1-C_6 -烷基硫烷基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1-C_4 -卤代烷基硫烷基； C_1-C_6 -烷基磺酰基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1-C_6 -卤代烷基磺酰基； C_2-C_8 -烯基； C_2-C_8 -炔基； C_3-C_6 -环烷基；苯基；三(C_1-C_6)烷基甲硅烷基；三(C_1-C_6)烷基甲硅烷基- C_1-C_6 -烷基。

[0124] R^b 特别优选代表氟、氯、溴； C_1-C_6 -烷基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1-C_4 -卤代烷基； C_1-C_4 -烷氧基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基； C_1-C_4 -烷基硫烷基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1-C_4 -卤代烷基硫烷基； C_1-C_4 -烷基磺酰基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基； C_2-C_6 -烯基； C_2-C_6 -炔基； C_3-C_6 -环烷基；苯基；三(C_1-C_4)烷基甲硅烷基；三(C_1-C_4)烷基甲硅烷基- C_1-C_4 -烷基。

[0125] R^b 非常特别优选代表氟、氯、溴；甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁

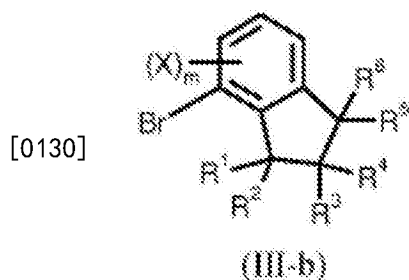
基、叔丁基、三氟甲基、三氯甲基、二氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、甲基硫烷基(methylsulfanyl)、三氟甲基硫烷基、乙烯基、烯丙基、乙炔基、炔丙基、环丙基、苯基、三甲基甲硅烷基。

[0126] 用于制备通式(I)的化合物的某些中间体是新的。因此,本发明还涉及可用于制备通式(I)的化合物的新的中间体化合物。因此,本发明提供了一种通式(III-a)的化合物。



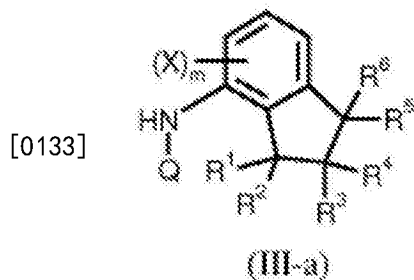
[0128] 其中,Q代表氢;X代表卤素、环丙基、甲基;m代表0或1; R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 彼此独立地代表氢、甲基、乙基、异丙基、异丁基、叔丁基、二甲基丙基、苄基、环戊基,条件是当 R^2 、 R^3 和 R^4 同时代表氢时, R^1 、 R^5 和 R^6 不同时代表甲基;或 R^3 和 R^4 可以和它们所连接的碳原子一起形成环戊基;或 R^5 和 R^6 可以和它们所连接的碳原子一起形成未取代的环丙基或被氯取代的环丙基或基团=N-O- R^c (其中 R^c 代表甲基、乙基、丙基或丁基)。

[0129] 本发明提供了一种通式(III-b)的化合物,



[0131] 其中,X代表卤素、环丙基、甲基;m代表0或1; R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 彼此独立地代表氢、甲基、乙基、异丙基、异丁基、叔丁基、二甲基丙基、苄基、环戊基,条件是当 R^2 、 R^3 和 R^4 同时代表氢时, R^1 、 R^5 和 R^6 不同时代表甲基; R^3 和 R^4 和它们所连接的碳原子一起形成环戊基; R^5 和 R^6 可以和它们所连接的碳原子一起形成未取代的环丁基或被氯取代的环丁基或基团=N-O- R^c (其中 R^c 代表甲基、乙基、丙基或丁基)。

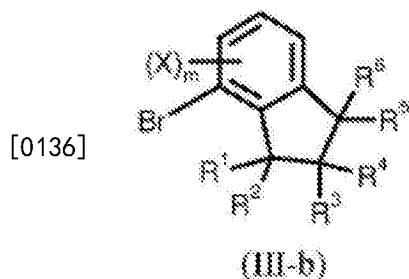
[0132] 用于制备通式(I)的化合物的某些中间体是新的。因此,本发明还涉及可用于制备通式(I)的化合物的新的中间体化合物。因此,本发明提供了一种通式(III-a)的化合物,



[0134] 其中,Q代表氢;X代表卤素、环丙基、甲基;m代表0或1; R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 彼此独立地代表氢、甲基、乙基、异丙基、苄基、异丁基,条件是当 R^2 、 R^3 和 R^4 同时代表氢时, R^1 、 R^5 和 R^6 不

同时代表甲基； R^3 和 R^4 可以和它们所连接的碳原子一起形成环戊基； R^5 和 R^6 可以和它们所连接的碳原子一起形成未取代的环丙基或被氯取代的环丙基或基团 $=N-O-R^c$ （其中 R^c 代表甲基、乙基、丙基或丁基）。

[0135] 本发明提供了一种通式(III-b)的化合物，



[0137] 其中，X代表卤素、环丙基、甲基；m代表0或1； R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 彼此独立地代表氢、甲基、乙基、异丙基、苄基、异丁基，条件是当 R^2 、 R^3 和 R^4 同时代表氢时， R^1 、 R^5 和 R^6 不同时代表甲基；或 R^3 和 R^4 和它们所连接的碳原子一起形成环己基； R^5 和 R^6 可以和它们所连接的碳原子一起形成未取代的环丁基或被氯取代的环丙基或基团 $=N-O-R^c$ （其中 R^c 代表甲基、乙基、丙基或丁基）。

[0138] 除非另有说明，根据本发明被取代的基团或取代基可被一种或多种选自以下的基团取代：卤素；硝基、氰基、 C_1 - C_{16} -烷基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷基； C_1 - C_6 -烷氧基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷氧基； C_1 - C_6 -烷基硫烷基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷基硫烷基； C_1 - C_6 -烷基磺酰基；具有1至9个相同或不同卤原子的 C_1 - C_6 -卤代烷基磺酰基； C_2 - C_{12} -烯基； C_2 - C_{12} -炔基； C_3 - C_7 -环烷基；苯基；三(C_1 - C_8)烷基甲硅烷基；三(C_1 - C_8)烷基甲硅烷基- C_1 - C_8 -烷基。

[0139] 最终，已发现新的式(I)的(硫代)甲酰胺具有优异的杀微生物特性，在作物保护和材料保护中可用于防治不想要的微生物。

[0140] 定义 C_1 - C_{16} 烷基包括此处针对烷基所定义的最大范围。具体而言，该定义包括甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基，以及戊基、己基、庚基、辛基、壬基、癸基、十一烷基、十二烷基、十三烷基、十四烷基、十五烷基和十六烷基的各自的所有同分异构体。优选范围是 C_2 - C_{12} 烷基，例如乙基、直链或支链的丙基、丁基、戊基、己基、庚基、辛基、壬基、癸基、十一烷基和十二烷基，特别为直链或支链的 C_3 - C_{10} 烷基，例如丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、正戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、1,2-二甲基丙基、1,1-二甲基丙基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、正己基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、1,1-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1-乙基-3-甲基丙基、正庚基、1-甲基己基、1-乙基戊基、2-乙基戊基、1-丙基丁基、辛基、1-甲基庚基、2-甲基庚基、1-乙基己基、2-乙基己基、1-丙基戊基、2-丙基戊基、壬基、1-甲基辛基、2-甲基辛基、1-乙基庚基、2-乙基庚基、1-丙基己基、2-丙基己基、癸基、1-甲基壬基、2-甲基壬基、1-乙基辛基、2-乙基辛基、1-丙基庚基和2-丙基庚基，尤其为丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、1,1-二甲基乙基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、戊基、1-甲基丁基、1-乙基丙基、己基、3-甲基戊基、庚基、1-甲基己基、1-乙基-3-甲基丁基、1-甲基庚基、1,2-二甲基己基、1,3-二甲基辛

基、4-甲基辛基、1,2,2,3-四甲基丁基、1,3,3-三甲基丁基、1,2,3-三甲基丁基、1,3-二甲基戊基、1,3-二甲基己基、5-甲基-3-己基、2-甲基-4-庚基、2,6-二甲基-4-庚基和1-甲基-2-环丙基乙基。

[0141] 卤素取代的烷基代表,例如,一氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、一氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基(chlorofluoromethyl)、二氯氟甲基(dichlorofluoromethyl)、氯二氟甲基(chlorodifluoromethyl)、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、3-氯-1-甲基丁基、2-氯-1-甲基丁基、1-氯丁基、3,3-二氯-1-甲基丁基、3-氯-1-甲基丁基、1-甲基-3-三氟甲基丁基、3-甲基-1-三氯甲基丁基。

[0142] 定义三(C₁-C₈)烷基甲硅烷基优选代表以下基团:SiMe₃、SiMe₂Et、SiMe₂CHMe₂、SiMe₂CH₂CHMe₂、SiMe₂CH₂CMe₃、SiMe₂CMe₃、SiMe₂CH₂CH₂Me。

[0143] 定义C₂-C₁₂烯基包括此处针对烯基所定义的最大范围。具体而言,该定义包括乙烯基、正丙烯基、异丙烯基、正丁烯基、异丁烯基、仲丁烯基、叔丁烯基,以及戊烯基、己烯基、庚烯基、辛烯基、壬烯基、癸烯基、十一碳烯基、十二碳烯基、1-甲基-1-丙烯基、1-乙基-1-丁烯基、2,4-二甲基-1-戊烯基和2,4-二甲基-2-戊烯基的各自的所有同分异构体。

[0144] 定义C₂-C₁₂炔基包括此处针对炔基所定义的最大范围。具体而言,该定义包括乙炔基、正丙炔基、异丙炔基、正丁炔基、异丁炔基、仲丁炔基、叔丁炔基,以及戊炔基、己炔基、庚炔基、辛炔基、壬炔基、癸炔基、十一碳炔基、十二碳炔基的各自的所有同分异构体。

[0145] 定义环烷基包括具有3至8个碳环成员的单环饱和烃基,例如环丙基,环丁基,环戊基,环己基,环庚基和环辛基。

[0146] 定义芳基包括未取代或取代的、芳香族的、一元、二元或三元环,例如苯基、萘基、蒽基、菲基。

[0147] 定义杂环包括未取代或取代的、包含最高达4个选自N、O、S的杂原子的5元至7元不饱和杂环:例如2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、2-吡咯基、3-吡咯基、1-吡咯基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、1-吡唑基、1H-咪唑-2-基、1H-咪唑-4-基、1H-咪唑-5-基、1H-咪唑-1-基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、3-异噁唑基、4-异噁唑基、5-异噁唑基、3-异噻唑基、4-异噻唑基、5-异噻唑基、1H-1,2,3-三唑-1-基、1H-1,2,3-三唑-4-基、1H-1,2,3-三唑-5-基、2H-1,2,3-三唑-2-基、2H-1,2,3-三唑-4-基、1H-1,2,4-三唑-3-基、1H-1,2,4-三唑-5-基、1H-1,2,4-三唑-1-基、4H-1,2,4-三唑-3-基、4H-1,2,4-三唑-4-基、1H-四唑-1-基、1H-四唑-5-基、2H-四唑-2-基、2H-四唑-5-基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,3,4-噁二唑-2-基、1,3,4-噻二唑-2-基、1,2,3-噁二唑-4-基、1,2,3-噁二唑-5-基、1,2,3-噻二唑-4-基、1,2,3-噻二唑-5-基、1,2,5-噁二唑-3-基、1,2,5-噻二唑-3-基、2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-哒嗪基、4-哒嗪基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、1,3,5-三嗪-2-基、1,2,4-三嗪-3-基、1,2,4-三嗪-5-基、1,2,4-三嗪-6-基。

[0148] 任选取代的基团可被单取代或多取代,其中在多取代的情况下,取代基可以是相同或不同的。因此,定义二烷基氨基还包括被烷基不对称取代的氨基,例如,甲基乙基氨基。

[0149] 被卤素取代的基团,例如卤代烷基,可以是单卤代或多卤代。在多卤代的情况中,卤原子可以是相同或不同的。此处,卤素代表氟、氯、溴和碘,特别代表氟、氯和溴。

[0150] 然而,上文给出的一般或优选的基团定义和说明也可以按照需要彼此结合,即,包括各自范围和优选范围之间的结合。它们适用于最终产物,并且相应地,适用于前体和中间体。

[0151] 然而,上文概括地给出的或在优选范围内所述的基团定义和说明也可按需要彼此结合,即包括特定范围和优选范围之间的结合。它们适用于最终产物,并且相应地适用于前体和中间体。此外,个别定义可能不适用。

[0152] 优选各个基团均具有上述优选定义的那些式(I)的化合物。

[0153] 特别优选各个基团均具有上述特别优选的定义的那些式(I)的化合物。

[0154] 非常特别优选各个基团均具有上述非常特别优选的定义的那些式(I)的化合物。

[0155] 在本发明的一个实施方案中,在式(I)的化合物中,Ha1¹和Ha1²分别代表氟。

[0156] 在本发明的一个实施方案中,在式(I)的化合物中,Ha1¹代表氟,Ha1²代表氯。

[0157] 在本发明的一个实施方案中,在式(I)的化合物中,R¹、R⁵和R⁶均代表甲基,R³代表甲基或异丙基。

[0158] 如果合适,本发明的化合物可作为不同的可能异构体形式的混合物存在,特别是立体异构体,例如E型和Z型、苏型(threo)和赤型(erythro)以及光学异构体,并且,如果合适,还包括互变异构体。本发明要求保护的包括E型和Z型异构体、苏型(threo)和赤型(erythro)及光学异构体、这些异构体的任意混合物,以及可能的互变异构体形式。

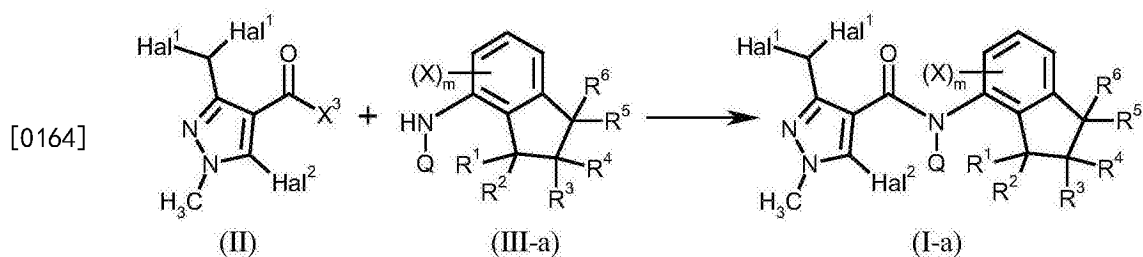
[0159] 如果合适,根据所述化合物中不对称中心的数量,本发明的化合物可以以一种或多种光学或手性异构体的形式存在。因此,本发明同样涉及所有光学异构体和它们的外消旋和成比例消旋(scalemic)混合物(术语“成比例消旋”表示不同比例的对映异构体的混合物),并且涉及所有可能的以不同比例混合的立体异构体的混合物。非对映异构体和/或所述光学异构体可以根据本领域普通技术人员已知的方法分离。

[0160] 如果合适,根据所述化合物中双键的数量,本发明的化合物可以以一种或多种几何异构体的形式存在。因此,本发明同样涉及所有的几何异构体和所有可能的以不同比例混合的混合物。所述几何异构体可以根据本领域普通技术人员已知的一般方法分离。

[0161] 如果合适,根据环B中取代基的相对位置(顺/反(syn/anti)或顺式/反式(cis/trans)),本发明的化合物可以以一种或多种几何异构体的形式存在。因此,本发明同样涉及所有的顺/反(或顺式/反式)异构体和所有可能的以不同比例混合的顺/反(或顺式/反式)异构体的混合物。顺/反(或顺式/反式)异构体可以根据本领域普通技术人员已知的一般方法分离。

[0162] 方法和中间体的说明

[0163] 式(I-a)的甲酰胺,即T代表氧时的式(I)的甲酰胺通过将式(II)的羰基卤化物或酸与式(III-a)的胺反应获得,如果合适在偶联剂的存在下,如果合适在酸粘合剂(acid binder)的存在下,以及如果合适在稀释剂的存在下[方法(a)]:



[0165] 式(II)提供了用于进行本发明的方法(a)的作为原料所需的羰基卤化物或酸的一般定义。

[0166] 在式(II)中, Hal¹和Hal²通常且优选具有在式(I)的化合物的描述中已提及的那些基团的含义。X³代表卤素或羟基或活化羟基, 优选代表氟、氯或羟基, 特别优选氯或羟基。

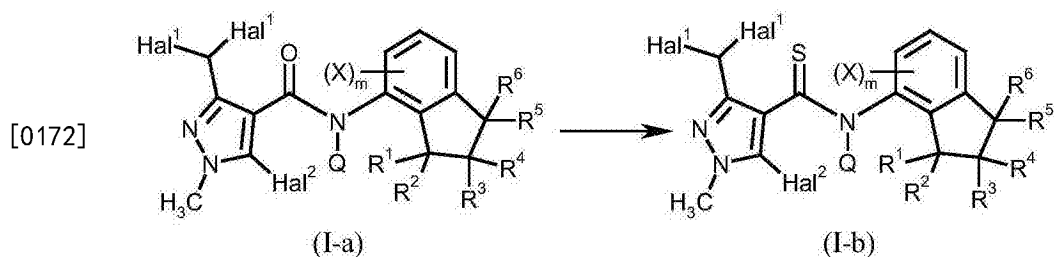
[0167] 活化羟基意指羟基与相邻的羰基形成酯, 该酯可以与氨基自发反应。常见的活性酯包括对硝基苯基酯、五氟苯基酯和琥珀酰亚胺基酯。

[0168] 式(II)的羰基卤化物或酸可通过已知的方法由市售原料制得(参见R.C.Larock Comprehensive organic transformations, 1989, VCH出版社)。

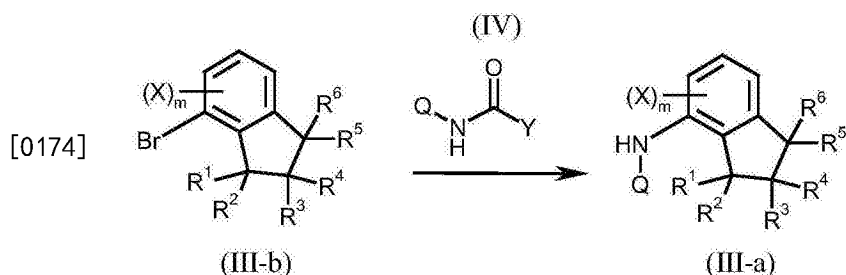
[0169] 式(III-a)提供了用于进行本发明的方法(a)的作为原料所需的胺的一般定义。

[0170] 在式(III-a)中, Q、X、m、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵和R⁶通常、优选、特别优选、非常特别优选具有在式(I)的化合物的描述中已提及的那些基团的含义。

[0171] 式(I-b)的硫代甲酰胺, 即, T代表硫时的式(I)的甲酰胺通过将式(I-a)的甲酰胺与硫羰化剂(thionating agent)反应获得, 如果合适在稀释剂的存在下, 以及如果合适在催化量或化学计量或更大量的碱的存在下[方法(b)]:



[0173] 用作原料的式(III-a)的化合物通过已知方法制得(Fragrance chemistry: the science of the sense of smell/edited by Ernst T.Theimer-Synthetic Benzenoid Musks by T.W.Wood; Chemistry--A European Journal, 8(4), 853-858; 2002; Tetrahedron, 59(37), 7389-7395; 2003; Journal of Medicinal Chemistry, 48(1), 71-90; 2005; Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters, 18(6), 1830-1834; 2008; US 5,521,317, WO 2010/109301); 可通过市售获得; 或可通过将式(III-b)的溴化物和式(IV)的化合物, 在催化剂的存在下, 任选在酸粘合剂的存在下, 在稀释剂的存在下进行反应, 随后利用合适的酸进行处理来制得[方法(c)]:



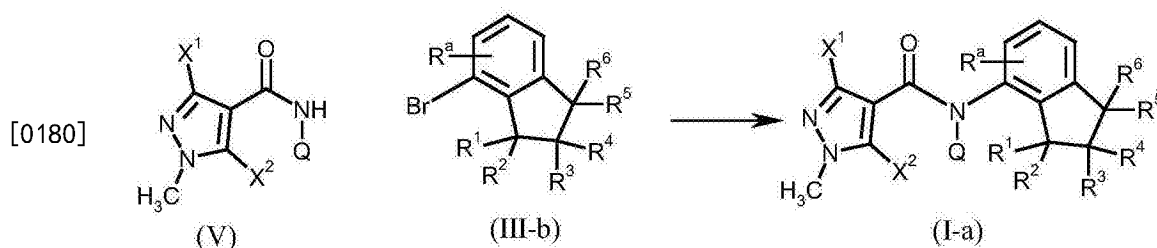
[0175] 式(III-b)提供了用于进行本发明的方法(c)的作为原料所需的溴化物的一般定义。

[0176] 在式(III-b)中,Q、X、m、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵和R⁶通常、优选、特别优选、非常特别优选在式(I)的化合物的描述中已提及的那些基团的含义。

[0177] 在式(IV)中,Q通常、优选、特别优选、非常特别优选在式(I)的化合物的描述中已提及的那些基团的含义,Y代表氢、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、苯氧基、苄氧基。

[0178] 用作原料的式(III-b)的化合物通过已知方法制得(Fragrance chemistry:the science of the sense of smell/edited by Ernst T.Theimer-Synthetic Benzenoid Musks by T.W.Wood;Chemistry--A European Journal,8(4),853-858;2002;Tetrahedron,59(37),7389-7395;2003;Journal of Medicinal Chemistry,48(1),71-90;2005;Bioorganic & Medicinal Chemistry Letters,18(6),1830-1834;2008;US 5,521,317,WO 2010/109301)或通过市售获得。

[0179] 式(I-a)的甲酰胺,即,T代表氧时的式(I)的甲酰胺还通过将式(V)的酰胺与式(III-b)的溴化物反应获得,如果合适在催化剂的存在下,如果合适在酸粘合剂的存在下,以及如果合适在稀释剂的存在下[方法(d)]:



[0181] 在式(V)中,Q、X¹和X²通常、优选、特别优选、非常特别优选具有在式(I)的化合物的描述中已提及的那些基团的含义。

[0182] 式(V)中的化合物通过已知方法制备(PCT Int.Appl.,2007057140)。

[0183] 用于进行本发明的方法(a)的合适的稀释剂为所有的惰性有机溶剂。这些惰性有机溶剂优选包括脂族、脂环族或芳香族的烃,例如石油醚、己烷、庚烷、环己烷、甲基环己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氢化萘;卤代烃,例如氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷;醚,如二乙醚、二异丙醚、甲基叔丁基醚、甲基叔戊基醚、二氧六环、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚;酮,例如丙酮、丁酮、甲基异丁基酮或环己酮;腈,例如乙腈、丙腈、正丁腈、异丁腈或苄腈;酰胺,例如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲基磷酰三胺;它们与水的混合物或纯水。

[0184] 如果合适,当X³代表卤素时,本发明的方法(a)在合适的酸受体存在下进行。合适

的酸受体为所有常见的无机碱或有机碱。其优选包括碱土金属或碱金属氢化物、氢氧化物、氨基化合物、醇盐、乙酸盐、碳酸盐或碳酸氢盐,例如,氢化钠、氨基钠、二异丙基氨基锂、甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾、氢氧化钠、氢氧化钾、乙酸钠、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸氢钠或碳酸铵,以及三级胺,例如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苄胺、吡啶、N-甲基吡啶、N-甲基吗啉、N,N-二甲基氨基吡啶、二氮杂二环辛烷(DABCO)、二氮杂二环壬烯(DBN)或二氮杂二环十一碳烯(DBU)。

[0185] 如果合适,当 X^3 代表羟基时,本发明的方法(a)在合适的偶联剂存在下进行。合适的偶联剂为所有常见的羰基活化剂。其优选包括N-[3-(二甲氨基)丙基]-N'-乙基-碳二亚胺盐酸盐、N,N'-二仲丁基碳二亚胺、N,N'-二环己基碳二亚胺、N,N'-二异丙基碳二亚胺、1-[3-(二甲氨基)丙基]-3-乙基碳二亚胺甲碘化物、2-溴-3-乙基-4-甲基噻唑鎓四氟硼酸盐(methylthiazolium tetrafluoroborate)、N,N-双[2-氧代-3-噁唑烷基]次磷酰氯、氯代三吡咯烷基磷六氟磷酸盐、溴代三吡咯烷基磷六氟磷酸盐、0-(1H-苯并三唑-1-基氧基)三(二甲氨基)磷六氟磷酸盐、0-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-四甲基脲六氟磷酸盐、0-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-双(四亚甲基)脲六氟磷酸盐、0-(1H-苯并三唑-1-基)-N,N,N',N'-双(四亚甲基)脲四氟硼酸盐、N,N,N',N'-双(四亚甲基)氯脲四氟硼酸盐(chlorouronium tetrafluoroborate)、0-(7-氮杂苯并三唑-1-基)-N,N,N,N-四甲基脲六氟磷酸盐和1-羟基苯并三唑。这些试剂可以单独使用,也可以结合起来使用。

[0186] 当进行本发明的方法(a)时,反应温度可在相对较宽的范围内变化。通常,该方法是在0℃至150℃的温度下进行,优选在20℃至110℃的温度下进行。

[0187] 在进行本发明的方法(a)以制备式(I-a)的化合物时,每摩尔式(II)的羰基卤化物或酸所需要的式(III-a)的胺的用量,通常为0.2至5mol,优选为0.5至2mol。以常规方法进行后处理。

[0188] 在进行本发明的方法(b)以制备式(I-b)的化合物时,式(I-a)的起始酰胺衍生物可通过方法(a)制备。

[0189] 用于进行本发明的方法(b)的合适的硫羰化剂可以是硫(S)、氢硫酸(H_2S)、硫化钠(Na_2S)、硫氢化钠($NaHS$)、三硫化二硼(B_2S_3)、硫化双(二乙基铝)(($AlEt_2$) $_2S$)、硫化铵((NH_4) $_2S$)、五硫化二磷(P_2S_5)、拉韦松试剂(Lawesson's reagent)(2,4-双(4-甲氧基苯基)-1,2,3,4-二硫杂二磷杂环丁烷(dithiadiphosphetane 2,4-二硫化物))或聚合物负载的硫羰化剂,例如J.Chem.Soc.,Perkin 1,2001,358中所描述。

[0190] 方法(c)在催化剂存在下,任选在酸粘合剂存在下,在稀释剂存在下进行,且随后用合适的酸处理。

[0191] 用于这种处理的合适的酸选自通常的波尔斯特酸(**Brønsted acid**),例如HCl、 H_2SO_4 、 $KHSO_4$ 、AcOH、三氟乙酸、对甲苯磺酸、樟脑磺酸、三乙醇胺-HCl、吡啶-HCl。

[0192] 用于进行本发明的方法(c)和(d)的合适的催化剂可选自金属盐或金属复合物。用于此目的的合适的金属衍生物基于钡或铜。用于此目的的合适的金属盐或金属复合物为氯化钡、乙酸钡、四(三苯基膦)钡、双(三苯基膦)钡二氯化物或1,1'-双(二苯基膦)二茂铁钡(II)氯化物、碘化铜、溴化铜、噻吩羧酸铜、三氟甲烷磺酸铜、氧化铜(I)。

[0193] 通过向反应中分别添加钡盐和配体或盐还可以在反应混合物中产生钡络合物,所述配体或盐为例如膦,如三乙基膦、三叔丁基膦、三环己基膦、2-(二环己基膦)联苯、2-(二

叔丁基膦)联苯、2-(二环己基膦)-2'-(N,N-二甲基氨基)联苯、三苯基膦、三(邻甲苯基)膦、3-(二苯基膦)苯磺酸钠、三-2-(甲氧基苯基)膦、2,2'-双(二苯基膦)-1,1'-联萘、1,4-双(二苯基膦)丁烷、1,2-双(二苯基膦)乙烷、1,4-双(二环己基膦)丁烷、1,2-双(二环己基膦)乙烷、2-(二环己基膦)-2'-(N,N-二甲基氨基)联苯、双(二苯基膦)二茂铁、三(2,4-叔丁基苯基)膦、(R)-(-)-1-[(S)-2-(二苯基膦)二茂铁]乙基二叔丁基膦、(S)-(+)-1-[(R)-2-(二苯基膦)二茂铁]乙基二环己基膦、(R)-(-)-1-[(S)-2-(二苯基膦)二茂铁]乙基二环己基膦、(S)-(+)-1-[(R)-2-(二苯基膦)二茂铁]乙基二叔丁基膦或1,3-双(2,4,6-三甲基苯基)咪唑鎓氯化物。

[0194] 在例如Strem Chemicals的“Metal Catalysts for Organic Synthesis”和Strem Chemicals的“Phosphorous Ligands and Compounds”等商品目录上选择合适的催化剂和/或配体也是有利的。

[0195] 当进行本发明的方法(c)时,反应温度可在相对较宽的范围内变化。通常,该方法在0℃至150℃的温度下进行,优选在20℃至110℃的温度下进行。

[0196] 在进行本发明的方法(c)以制备式(III-a)的化合物时,每摩尔式(III-b)的溴化物所需要的式(IV)的化合物的用量,通常为0.2至5mol,优选为0.5至2mol。以常规方法进行后处理。

[0197] 方法(d)任选在催化剂的存在下,任选在酸粘合剂的存在下,或任选在稀释剂的存在下进行。

[0198] 用于进行本发明的方法(b)、(c)和(d)的合适的稀释剂为所有的惰性有机溶剂。这些惰性有机溶剂优选包括脂族、脂环族或芳香族的烃,例如石油醚、己烷、庚烷、环己烷、甲基环己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氢化萘;卤代烃,例如氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷;醚,例如二乙醚、二异丙醚、甲基叔丁基醚、甲基叔戊基醚、二氧六环、四氢呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚;酮,例如丙酮、丁酮、甲基异丁酮或环己酮;腈,例如乙腈、丙腈、正丁腈或异丁腈或苄腈;酰胺,例如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺、N-甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮或六甲基磷酰三胺;它们与水的混合物或纯水。

[0199] 用于此目的的合适的催化剂为,例如,可通过向反应混合物中分别添加铜盐(例如碘化铜、溴化铜、噻吩羧酸铜、三氟甲烷磺酸铜、氧化铜(I))和配体(例如1,2-环己基二胺、N,N'-二甲基乙二胺、N,N'-二甲基环己胺)而制备的铜络合物。

[0200] 当进行本发明的方法(d)时,反应温度可在相对较宽的范围内变化。通常,该方法在0℃至150℃的温度下进行,优选在60℃至140℃的温度下进行。

[0201] 在进行本发明的方法(d)以制备式(I-a)的化合物时,每摩尔式(III-b)的溴化物所需要的式(V)的化合物的用量,通常为0.2至5mol,优选为0.5至2mol。以常规方法进行后处理。

[0202] 用于进行本发明的方法(a)、(c)和(d)的合适的酸粘合剂可为用于此类反应的常见的无机碱和有机碱。优选使用碱土金属氢氧化物或碱金属氢氧化物,例如氢氧化钠、氢氧化钙、氢氧化钾或其他的氢氧化铵的衍生物;碱金属碳酸盐,例如碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸氢钠;碱金属乙酸盐或碱土金属乙酸盐,例如乙酸钠、乙酸钾、乙酸钙;以及叔胺,例如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N,N-二甲基苯胺、吡啶、N-甲基吡啶、N,N-二甲基氨基吡啶、二氮

杂二环辛烷 (DABCO)、二氮杂二环壬烯 (DBN) 或二氮杂二环十一碳烯 (DBU)。

[0203] 用于进行本发明的方法 (b) 的合适的碱可为用于此类反应的常见的无机碱和有机碱。优选使用碱土金属氢氧化物或碱金属氢氧化物, 例如氢氧化钠、氢氧化钙、氢氧化钾或其他的氢氧化铵的衍生物; 碱金属碳酸盐, 例如碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钾、碳酸氢钠; 碱金属乙酸盐或碱土金属乙酸盐, 例如乙酸钠、乙酸钾、乙酸钙; 以及叔胺, 例如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N,N-二甲基苯胺、吡啶、N-甲基吡啶、N,N-二甲基氨基吡啶、二氮杂二环辛烷 (DABCO)、二氮杂二环壬烯 (DBN) 或二氮杂二环十一碳烯 (DBU)。

[0204] 所述方法 (a)、(b)、(c) 和 (d) 通常在大气压下进行。然而, 也可在高压或减压下 (通常在 0.1 巴至 100 巴之间) 进行。

[0205] 组合物/制剂

[0206] 本发明还涉及用于防治不想要的微生物、特别是不想要的真菌和细菌的作物保护组合物, 所述组合物包含有效且非植物毒性量的本发明的活性成分。它们优选为杀真菌剂组合物, 其包含在农业上合适的助剂、溶剂、载体、表面活性剂或填充剂。

[0207] 在本发明的上下文中, “防治有害微生物” 意指与未处理植物相比有害微生物侵袭的减少, 其被测定为杀真菌的效率, 相比于未处理的植物 (100%) 优选减少 25 至 50%, 相比于未处理的植物 (100%) 更优选减少 40 至 79%, 甚至更优选为完全抑制有害微生物的感染 (减少 70 至 100%)。该防治可以是治疗性的, 即, 用于已被感染的植物的治疗, 或者该防治可以是保护性的, 即, 用于保护未被感染的植物。

[0208] “有效且非植物毒性量” 意指足以令人满意地防治植物真菌病害或足以完全根除真菌病害且同时不会引起任何明显的植物毒性症状的本发明组合物的量。通常这种施用率可以在较宽的范围内变化。它取决于若干因素, 例如待防治的真菌、植物、气候条件和本发明组合物的成分。

[0209] 合适的有机溶剂包括通常用于制剂目的的所有极性和非极性有机溶剂。优选的有机溶剂选自: 酮, 例如甲基异丁基酮和环己基酮; 酰胺, 例如二甲基甲酰胺; 链烷羧酸酰胺 (alkanecarboxylic acid amides), 例如 N,N-二甲基癸酰胺和 N,N-二甲基辛酰胺, 以及环状溶剂 (cyclic solvents), 例如 N-甲基吡咯烷酮、N-辛基吡咯烷酮、N-十二烷基吡咯烷酮、N-辛基己内酰胺、N-十二烷基己内酰胺和丁内酯; 以及强极性溶剂, 例如二甲亚砜; 以及芳香烃, 例如二甲苯、Solvesso™; 矿物油, 例如石油溶剂油、石油、烷基苯和锭子油; 以及酯, 例如丙二醇单甲醚乙酸酯、己二酸二丁酯、乙酸己酯、乙酸庚酯、柠檬酸三正丁酯、邻苯二甲酸二正丁酯; 以及醇, 例如苄醇和 1-甲氧基-2-丙醇。

[0210] 根据本发明, 载体为天然的或合成的、有机的或无机的物质, 活性化合物与其混合或结合以便更好地施用, 特别是施用于植物或植物部位或种子。载体 (可为固体或液体) 通常是惰性的且适用于农业。

[0211] 有用的固体或液体载体包括: 例如铵盐、天然的岩石粉末 (例如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱土或硅藻土)、合成的岩石粉末 (例如细碎的二氧化硅、氧化铝和天然或合成的硅酸盐)、树脂、蜡、固体肥料、水、醇 (特别是丁醇)、有机溶剂、矿物油和植物油, 及其衍生物。也可使用这些载体的混合物。

[0212] 合适的固体填料和载体包括无机颗粒, 例如平均粒径为 0.005 至 20 μm、优选为 0.02 至 10 μm 的碳酸盐、硅酸盐、硫酸盐和氧化物, 例如硫酸铵、磷酸铵、尿素、碳酸钙、硫酸钙、硫

酸镁、氧化镁、氧化铝、二氧化硅、所谓的细颗粒二氧化硅、硅胶,天然或合成的硅酸盐和硅铝酸盐,以及植物产品如谷物面粉、木材粉末/木屑和纤维素粉末。

[0213] 用于颗粒剂的有用的固体载体包括:例如粉碎的和分级的天然岩石,例如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石,以及合成的无机和有机粉末的颗粒,以及有机物质的颗粒,例如木屑、椰壳、玉米穗轴及烟草茎。

[0214] 有用的液化气态填充剂或载体是指在标准温度及大气压下为气态的那些液体,例如气溶胶推进剂,如卤代烃,以及丁烷、丙烷、氮气和二氧化碳。

[0215] 在制剂中,可使用增粘剂(例如羧甲基纤维素),粉末、颗粒或胶乳形式的天然和合成的聚合物(例如阿拉伯树胶、聚乙烯醇及聚乙酸乙烯酯),或天然磷脂(例如脑磷脂及卵磷脂),以及合成磷脂。其他添加剂可为矿物油和植物油。

[0216] 如果所用填充剂为水,则还可使用例如有机溶剂作为辅助溶剂。有用的液体溶剂基本上为:芳香族化合物,例如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯代芳香族化合物和氯代脂族烃,例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷;脂族烃,例如环己烷或石蜡,例如矿物油馏分、矿物油和植物油;醇(例如丁醇或乙二醇)及其醚和酯;酮,例如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮或环己酮;强极性溶剂,例如二甲基甲酰胺和二甲基亚砷;以及水。

[0217] 合适的表面活性剂(助剂、乳化剂、分散剂、保护性胶体、润湿剂和粘结剂)包括所有常见的离子和非离子物质,例如乙氧基化的壬基酚、直链或支链醇的聚亚烷基二醇醚、烷基酚与环氧乙烷和/或环氧丙烷的反应产物、脂肪酸胺与环氧乙烷和/或环氧丙烷的反应产物,以及脂肪酸酯、烷基磺酸盐、烷基硫酸盐、烷基醚硫酸盐、烷基醚磷酸盐、芳基硫酸盐、乙氧基化的芳基烷基酚(如三苯乙基-苯酚-乙氧基化合物),以及乙氧基化的和丙氧基化的芳基烷基酚如硫酸化和磷酸化的芳基烷基酚-乙氧基化合物和丙氧基化合物。其他实例为天然或合成的水溶性聚合物,如木素磺酸盐、白明胶、阿拉伯树胶、磷脂、淀粉、疏水改性淀粉和纤维素衍生物,特别是纤维素酯和纤维素醚,以及聚乙烯醇、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯基吡咯烷酮、聚丙烯酸、聚甲基丙烯酸以及(甲基)丙烯酸和(甲基)丙烯酸酯的共聚物,以及被碱金属氢氧化物中和的甲基丙烯酸和甲基丙烯酸酯的共聚物,以及任选取代的萘磺酸盐与甲醛的缩合物。当活性化合物和/或惰性载体在水中施用,如果它们其中之一不溶于水,则需要表面活性剂的存在。表面活性剂的比例为本发明组合物的5至40重量%。

[0218] 可使用着色剂,例如无机颜料,如氧化铁、氧化钛和普鲁士蓝;以及有机染料,例如茜素染料、偶氮染料和金属酞菁染料;以及微量营养素,例如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[0219] 可存在于制剂中的消泡剂包括例如硅氧烷乳液、长链的醇类、脂肪酸及其盐,以及含氟有机物及其混合物。

[0220] 增稠剂的实例为多糖,例如黄原胶或硅酸镁铝;硅酸盐,例如绿坡缕石、蒙脱土或细颗粒二氧化硅。

[0221] 如果合适,制剂中也可存在其他组分,例如保护性胶体、粘合剂、粘结剂、增稠剂、触变剂、渗透剂、稳定剂、螯合剂、络合剂。通常,活性成分可以与常用于制剂的任意固体或液体添加剂结合使用。

[0222] 根据它们特殊的物理特性和/或化学特性,本发明的活性成分或组合物可以单独使用,或以它们的制剂形式或由制剂制备的使用形式而使用,例如气溶胶分散剂、胶囊悬浮

剂、冷雾浓缩剂、热雾浓缩剂、胶囊化的颗粒剂、细颗粒剂、用于种子处理的流动性浓缩剂(flowable concentrates for the treatment of seed)、即用型溶液、粉剂、可乳化的浓缩剂、水包油乳剂、油包水乳剂、大颗粒剂(macrogranules)、微颗粒剂(microgranules)、油分散性粉末剂、油混溶性流动浓缩剂(oil-miscible flowable concentrates)、油混溶性液体、气剂(gas) (在施加压力下)、产气剂、泡沫剂(foams)、糊剂(pastes)、农药种衣剂、悬浮浓缩剂、悬乳浓缩剂(suspoemulsion concentrates)、可溶性浓缩剂、混悬剂、可湿性粉剂、可溶性粉剂、粉剂和颗粒剂、水溶性和水分散性的颗粒剂或片剂、用于种子处理的水溶性或水分散性粉剂,可湿性粉剂、经活性物质浸渍的天然产物及合成物质,以及聚合物微胶囊和种衣剂微胶囊,以及ULV冷雾和热雾制剂。

[0223] 本发明的组合物不仅包括可通过合适装置施用到植物或种子上的即用型制剂,还包括在使用之前必须用水稀释的市售浓缩剂。常规用法例如在水中稀释后喷洒所得喷洒液、在油中稀释后施用、无需稀释直接施用、颗粒剂的种子处理或土壤施用。

[0224] 本发明的组合物和制剂通常含有0.05至99重量%、0.01至98重量%、优选0.1至95重量%、更优选0.5至90重量%、最优选10至70重量%的活性成分。对于特殊应用,例如木材和衍生的木材产品的保护,本发明的组合物和制剂通常含有0.0001至95%重量%、优选0.001至60重量%的活性成分。

[0225] 由市售制剂制备的施用形式中的活性成分的含量可在较宽的范围内变化。施用形式中的活性成分的浓度通常在0.000001和95重量%之间,优选在0.0001和2重量%之间。

[0226] 上述制剂可用本身已知的方法制备,例如通过将活性成分与至少一种常见填充剂、溶剂或稀释剂、辅助剂、乳化剂、分散剂和/或粘合剂或固定剂、润湿剂、防水剂、任选干燥剂和UV稳定剂,以及任选染料和颜料、消泡剂、防腐剂、无机和有机的增稠剂、粘结剂、赤霉素,以及其他加工助剂和水。根据所要制备的制剂种类,其他加工步骤是必需的,如湿法研磨,干法研磨及造粒。

[0227] 本发明的活性成分可以自身形式存在,或以其(市售)制剂形式存在,或以由这些制剂和其他(已知)活性成分的混合物制备的使用形式存在,所述其他(已知)活性成分例如杀虫剂、引诱剂、消毒剂、杀细菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生长调节剂、除草剂、肥料、安全剂和/或化学信息素。

[0228] 利用活性成分或组合物对植物和植物部位进行的本发明的处理可直接进行或通过常见处理方法作用于它们的周围环境、栖息地或存贮空间进行,所述常见处理方法例如通过浸渍、喷洒、喷雾、灌溉、蒸发、撒粉、弥雾、撒播、发泡、涂抹、涂布、浇水(浇灌)、滴注,对于繁殖材料,特别是对于种子,还可通过干种子处理、湿种子处理、浆液处理、表面硬化、涂布一层或多层包衣等。还可通过超低容量法或将活性成分制剂或活性成分本身注射到土壤中来有效利用活性成分。

[0229] 植物/作物保护

[0230] 本发明的活性成分或组合物具有潜在的杀微生物活性,在作物保护和材料保护中,可用于防治不想要的微生物,例如真菌和细菌。

[0231] 本发明还涉及一种用于防治不需要的微生物的方法,其特征在于,本发明的活性成分被施用于植物病原真菌、植物病原体细菌和/或它们的栖息地。

[0232] 杀真菌剂可用在作物保护中,以防治植物病原真菌。它们的特征是针对广谱植物

病原真菌(包括土壤传播性病原菌,其特别为根肿菌纲(Plasmodiophoromycetes)、霜霉纲(Peronosporomycetes)(卵菌纲(Syn.Oomycetes))、壶菌纲(Chytridiomycetes)、接合菌纲(Zygomycetes)、子囊菌纲(Ascomycetes)、担子菌纲(Basidiomycetes)和半知菌纲(Deuteromycetes)(不完全菌纲(Syn.Fungi imperfecti))的成员)具有显著功效。一些杀真菌剂具有系统活性,可以在植物保护中用作叶面肥(foliar)、拌种剂或土壤杀真菌剂。此外,它们适合用于防治感染木材或植物根部的真菌。

[0233] 杀菌剂可被用于作物保护,以防治假单孢菌(Pseudomonadaceae)、根瘤菌(Rhizobiaceae)、肠杆菌(Enterobacteriaceae)、棒杆菌(Corynebacteriaceae)以及链霉菌(Streptomycetaceae)。

[0234] 可以根据本发明治疗的真菌病害的病原体的非限制性实施例包括:

[0235] 由白粉病病原体引起的病害,例如,布氏白粉菌(Blumeria)属,例如禾本科布氏白粉菌(Blumeria graminis);叉丝单囊壳(Podosphaera)属,例如白叉丝单囊壳(Podosphaera leucotricha);单囊壳(Sphaerotheca)属,例如凤仙花单囊壳(Sphaerotheca fuliginea);钩丝壳(Uncinula)属,例如葡萄钩丝壳(Uncinula necator);

[0236] 由锈病病原体引起的病害,例如,胶锈菌(Gymnosporangium)属,例如褐色胶锈菌(Gymnosporangium sabinae);驼孢锈(Hemileia)属,例如咖啡驼孢锈菌(Hemileia vastatrix);层锈菌(Phakopsora)属,例如豆薯层锈菌(Phakopsora pachyrhizi)和山马蝗层锈菌(Phakopsora meibomiae);柄锈菌(Puccinia)属,例如隐匿柄锈菌(Puccinia recondita)、小麦杆锈菌(Puccinia graminis)或小麦条锈菌(Puccinia striiformis);单胞锈菌(Uromyces)属,例如疣顶单胞锈菌(Uromyces appendiculatus);

[0237] 由卵菌纲(Oomycete)病原体引起的病害,例如,白锈菌(Albugo)属,例如白锈菌(Albugo candida);盘霜霉(Bremia)属,例如莴苣盘霜霉(Bremia lactucae);霜霉(Peronospora)属,例如豌豆霜霉(Peronospora pisi)或十字花科霜霉(Peronospora brassicae);疫霉(Phytophthora)属,例如致病疫霉(Phytophthora infestans);轴霜霉(Plasmopara)属,例如葡萄生轴霜霉(Plasmopara viticola);假霜霉(Pseudoperonospora)属,例如草假霜霉(Pseudoperonospora humuli)或古巴假霜霉(Pseudoperonospora cubensis);腐霉(Pythium)属,例如终极腐霉(Pythium ultimum);

[0238] 由下述病原体引起的叶斑枯病(Leaf blotch)和叶萎蔫病(leaf wilt)病害:例如,链格孢(Alternaria)属,例如早疫病链格孢(Alternaria solani);尾孢(Cercospora)属,例如菜生尾孢(Cercospora beticola);枝孢(Cladosporium)属,例如黄瓜枝孢(Cladosporium cucumerinum);旋孢腔菌(Cochliobolus)属,例如禾旋孢腔菌(Cochliobolus sativus)(分生孢子形式:内脐蠕孢属(Drechslera),Syn:长蠕孢菌(Helminthosporium))、宫部旋孢霉(Cochliobolus miyabeanus);炭疽菌(Colletotrichum)属,例如菜豆炭疽菌(Colletotrichum lindemuthianum);锈斑病菌(Cycloconium)属,例如孔雀斑病(Cycloconium oleaginum);间座壳(Diaporthe)属,例如柑桔间座壳(Diaporthe citri);痂囊腔菌(Elsinoe)属,例如柑桔痂囊腔菌(Elsinoe fawcettii);盘长孢(Gloeosporium)属,例如悦色盘长孢(Gloeosporium laeticolor);小丛壳(Glomerella)属,例如围小丛壳(Glomerella cingulata);球座菌(Guignardia)属,例如葡萄球座菌(Guignardia bidwelli);小球腔菌(Leptosphaeria)属,例如斑污小球腔菌

(*Leptosphaeria maculans*) ; 大毀壳 (*Magnaporthe*) 属, 例如灰色大毀壳 (*Magnaporthe grisea*) ; 微座孢属 (*Microdochium*) , 例如雪霉微座孢 (*Microdochium nivale*) ; 球腔菌 (*Mycosphaerella*) 属, 例如禾生球腔菌 (*Mycosphaerella graminicola*)、落花生球腔菌 (*M.arachidicola*) 和斐济球腔菌 (*M.fijiensis*) ; 壳针孢 (*Phaeosphaeria*) 属, 例如颖枯壳针孢 (*Phaeosphaeria nodorum*) ; 核腔菌 (*Pyrenophora*) 属, 例如圆核腔菌 (*Pyrenophora teres*)、偃麦草核腔菌 (*Pyrenophora tritici-repentis*) ; 柱隔孢 (*Ramularia*) 属, 例如辛加柱隔孢 (*Ramularia collo-cygni*)、白斑柱隔孢 (*Ramularia areola*) ; 喙孢 (*Rhynchosporium*) 属, 例如黑麦喙孢 (*Rhynchosporium secalis*) ; 针孢 (*Septoria*) 属, 例如芹菜小壳针孢 (*Septoria apii*)、番茄壳针孢 (*Septoria lycopersii*) ; 核瑚菌 (*Typhula*) 属, 例如肉孢核瑚菌 (*Typhula incarnata*) ; 黑星菌 (*Venturia*) 属, 例如苹果黑星病菌 (*Venturia inaequalis*) ;

[0239] 由下述病原体引起的根和茎的病害: 例如, 伏革菌 (*Corticium*) 属, 例如禾伏革菌 (*Corticium graminearum*) ; 镰孢 (*Fusarium*) 属, 例如尖镰孢 (*Fusarium oxysporum*) ; 顶囊壳 (*Gaeumannomyces*) 属, 例如禾顶囊壳 (*Gaeumannomyces graminis*) ; 丝核菌 (*Rhizoctonia*) 属, 例如立枯丝核菌 (*Rhizoctonia solani*) ; 例如由稻帚枝杆孢 (*Sarocladium oryzae*) 引起的帚枝杆孢 (*Sarocladium*) 属病害; 由稻腐小核菌 (*Sclerotium oryzae*) 引起的小核菌 (*Sclerotium*) 属病害; 塔普斯 (*Tapesia*) 属, 例如塔普斯梭状芽孢杆菌 (*Tapesia acuformis*) ; 根串珠霉 (*Thielaviopsis*) 属, 例如根串珠霉 (*Thielaviopsis basicola*) ;

[0240] 由下述病原体引起的肉穗花序或散穗花序病害 (包括玉米穗轴) : 例如, 链格孢 (*Alternaria*) 属, 例如链格孢属 (*Alternaria* spp.) ; 曲霉 (*Aspergillus*) 属, 例如黄曲霉 (*Aspergillus flavus*) ; 枝孢 (*Cladosporium*) 属, 例如芽枝状枝孢 (*Cladosporium cladosporioides*) ; 麦角菌 (*Claviceps*) 属, 例如麦角菌 (*Claviceps purpurea*) ; 镰孢 (*Fusarium*) 属, 例如黄色镰孢 (*Fusarium culmorum*) ; 赤霉 (*Gibberella*) 属, 例如玉蜀黍赤霉 (*Gibberella zeae*) ; 小画线壳 (*Monographella*) 属, 例如雪腐小画线壳 (*Monographella nivalis*) ; 壳多孢 (*Stagonospora*) 属, 例如颖枯壳多孢 (*Stagonospora nodorum*) ;

[0241] 由黑粉菌引起的病害, 例如, 轴黑粉菌 (*Sphacelotheca*) 属, 例如丝孢堆黑粉菌 (*Sphacelotheca reiliana*) ; 腥黑粉菌 (*Tilletia*) 属, 例如小麦网腥黑粉菌 (*Tilletia caries*)、小麦矮腥黑粉菌 (*T.controversa*) ; 条黑粉菌 (*Urocystis*) 属, 例如隐条黑粉菌 (*Urocystis occulta*) ; 黑粉菌 (*Ustilago*) 属, 例如裸黑粉菌 (*Ustilago nuda*)、小麦散黑粉菌 (*U.nuda tritici*) ;

[0242] 由下列病原体导致的果实腐烂: 例如, 曲霉 (*Aspergillus*) 属, 例如黄曲霉 (*Aspergillus flavus*) ; 葡萄孢 (*Botrytis*) 属, 例如灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*) ; 青霉 (*Penicillium*) 属, 例如扩展青霉 (*Penicillium expansum*) 和产紫青霉 (*P.purpurogenum*) ; 核盘菌 (*Sclerotinia*) 属, 例如核盘菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*) ; 轮枝菌 (*Verticilium*) 属, 例如黑白轮枝菌 (*Verticilium albo-atrum*) ;

[0243] 由下述病原体引起的种传的和土传的腐烂、发霉、萎蔫、腐坏和立枯病: 例如, 链格孢 (*Alternaria*) 属, 例如芸薹链格孢 (*Alternaria brassicicola*) ; 丝囊霉 (*Aphanomyces*) 属, 例如根腐丝囊霉 (*Aphanomyces euteiches*) ; 壳二孢 (*Ascochyta*) 属, 例如兵豆壳二孢

(*Ascochyta lentis*); 曲霉 (*Aspergillus*) 属, 例如黄曲霉 (*Aspergillus flavus*); 枝孢 (*Cladosporium*) 属, 例如草本枝孢 (*Cladosporium herbarum*); 旋孢腔菌 (*Cochliobolus*) 属, 例如禾旋孢腔菌 (*Cochliobolus sativus*) (分生孢子形式: 内脐蠕孢属, 离蠕孢属 (*Bipolaris*) Syn: 长蠕孢菌); 炭疽菌 (*Colletotrichum*) 属, 例如毛核炭疽菌 (*Colletotrichum coccodes*); 镰孢 (*Fusarium*) 属, 例如黄色镰孢 (*Fusarium culmorum*); 赤霉 (*Gibberella*) 属, 例如玉蜀黍赤霉 (*Gibberella zeae*); 壳孢 (*Macrophomina*) 属, 例如菜豆壳孢 (*Macrophomina phaseolina*); 小画线壳 (*Monographella*) 属, 例如雪腐小画线壳 (*Monographella nivalis*); 青霉 (*Penicillium*) 属, 例如扩展青霉 (*Penicillium expansum*); 茎点霉 (*Phoma*) 属, 例如黑胫茎点霉 (*Phoma lingam*); 拟茎点霉 (*Phomopsis* species) 属, 例如大豆拟茎点霉 (*Phomopsis sojae*); 疫霉 (*Phytophthora*) 属, 例如恶疫霉 (*Phytophthora cactorum*); 核腔菌 (*Pyrenophora*) 属, 例如麦类核腔菌 (*Pyrenophora graminea*); 梨孢 (*Pyricularia*) 属, 例如稻梨孢 (*Pyricularia oryzae*); 腐霉 (*Pythium*) 属, 例如终极腐霉 (*Pythium ultimum*); 丝核菌 (*Rhizoctonia*) 属, 例如立枯丝核菌 (*Rhizoctonia solani*); 根霉菌 (*Rhizopus*) 属, 例如稻根霉菌 (*Rhizopus oryzae*); 小核菌 (*Sclerotium*) 属, 例如齐整小核菌 (*Sclerotium rolfisii*); 壳针孢 (*Septoria*) 属, 例如颖枯壳针孢 (*Septoria nodorum*); 核瑚菌属 (*Typhula*), 例如肉孢核瑚菌 (*Typhula incarnata*); 轮枝孢菌属 (*Verticillium*), 例如大丽花轮枝孢 (*Verticillium dahliae*);

[0244] 由下述病原体引起的癌性病害、菌瘿和扫帚病 (witches' broom): 例如, 丛赤壳 (*Nectria*) 属, 例如仁果干癌丛赤壳菌 (*Nectria galligena*);

[0245] 由下述病原体引起的萎缩病害: 例如, 链核盘菌 (*Monilinia*) 属, 例如核果链核盘菌 (*Monilinia laxa*);

[0246] 由下述病原体引起的叶疱病、缩叶病: 例如, 外担菌 (*Exobasidium*) 属, 例如坏损外担菌 (*Exobasidium vexans*); 外囊菌属 (*Taphrina*), 例如桃外囊菌 (*Taphrina deformans*);

[0247] 由下述病原体引起的木本植物退行性病害: 例如, 例如由根霉格孢菌 (*Phaeomoniella chlamydospora*)、鸡腿蘑丝孢 (*Phaeoacremonium aleophilum*) 和地中海孢孔菌 (*Fomitiporia mediterranea*) 引起的依科病 (*Esca*); 例如由葡萄藤猝倒病菌 (*Eutypa lata*) 引起的葡萄顶枯病 (*Eutypa dyebank*); 例如由狭长孢灵芝 (*Ganoderma boninense*) 引起的灵芝 (*Ganoderma*) 属病害; 例如由木硬孔菌 (*Rigidoporus lignosus*) 引起的硬孔菌 (*Rigidoporus*) 属病害;

[0248] 由下述病原体引起的花和种子的病害: 例如, 葡萄孢 (*Botrytis*) 属, 例如灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*);

[0249] 由下述病原体引起的植物块茎的病害: 例如, 丝核菌 (*Rhizoctonia*) 属, 例如立枯丝核菌 (*Rhizoctonia solani*); 长蠕孢菌 (*Helminthosporium*) 属, 例如茄病长蠕孢 (*Helminthosporium solani*);

[0250] 由下述病原体引起的根肿病害: 例如, 根肿菌属 (*Plasmodiophora*), 例如云蕈根肿菌 (*Plasmodiophora brassicae*);

[0251] 由下述细菌性病原体引起的病害: 例如, 黄单胞菌 (*Xanthomonas*) 属, 例如稻黄单胞菌白叶枯变种 (*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*); 假单胞菌 (*Pseudomonas*) 属, 例如丁香假单胞菌 (*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*); 欧文氏菌 (*Erwinia*) 属, 例如噬淀

粉欧文氏菌(*Erwinia amylovora*)。

[0252] 下述大豆病害可被优选防治：

[0253] 由下述病原体引起的叶、茎、荚和种子的真菌病害：例如，轮纹叶斑病(*Alternaria leaf spot*)(*Alternaria spec.atrans tenuissima*)、炭疽病(*Anthracnose*)(*Colletotrichum gloeosporoides dematium var.truncatum*)、褐斑病(*brown spot*) (大豆壳针孢(*Septoria glycines*))、桃叶穿孔病和叶枯病(菊池尾孢(*Cercospora kikuchii*))、笄霉叶枯病(漏斗笄霉(*Choanephora infundibulifera trispora* (Syn)))、*dactuliophora*叶斑病(*Dactuliophora glycines*)、大豆霜霉病(*downy mildew*) (东北霜霉(*Peronospora manshurica*))、禾内脐蠕孢枯萎病(*Drechslera glycini*)、蛙眼病(*frogeye leaf spot*) (大豆尾孢(*Cercospora sojae*))、菜豆叶斑病(三叶草小光壳(*Leptosphaerulina trifolii*))、叶点霉叶斑病(大豆生叶点霉(*Phyllosticta sojaecola*))、荚和茎枯萎病(大豆拟茎点霉(*Phomopsis sojae*))、白粉病(*Microsphaera diffusa*)、棘壳孢叶斑病(*Pyrenochaeta glycines*)、*rhizoctonia aerial*、叶枯病和立枯病(*foliage and web blight*) (立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*))、锈病(豆薯层锈菌(*Phakopsora pachyrhizi*)、山马蝗层锈菌(*Phakopsora meibomiae*))、黑星病(*scab*) (大豆痂圆孢(*Sphaceloma glycines*))；匍柄霉叶枯病(匍柄霉(*Stemphylium botryosum*))；靶斑病(*target spot*) (山扁豆生棒孢(*Corynespora cassiicola*))。

[0254] 由下述病原体引起的根部和茎部的真菌病害：例如，黑色根腐病(野百合丽赤壳菌(*Calonectria crotalariae*))、炭腐病(菜豆生壳球孢(*Macrophomina phaseolina*))、镰孢枯萎病或萎蔫、根腐以及荚和根颈腐烂病(尖镰孢(*Fusarium oxysporum*)、直喙镰孢(*Fusarium orthoceras*)、半裸镰孢(*Fusarium semitectum*)、木贼镰孢(*Fusarium equiseti*))、*mycoleptodiscus*根腐病(*Mycoleptodiscus terrestris*)、新赤壳属病(*neocosmospora*) (侵菅新赤壳(*Neocosmopora vasinfecta*))、荚和茎疫病(*pod and stem blight*) (菜豆间座壳(*Diaporthe phaseolorum*))、茎腐败(大豆北方茎溃疡病菌(*Diaporthe phaseolorum var.caulivora*))、疫霉腐病(大雄疫霉(*Phytophthora megasperma*))、褐茎腐病(大豆茎褐腐病菌(*Phialophora gregata*))、腐霉病(*pythium rot*) (瓜果腐霉(*Pythium aphanidermatum*)、畸雌腐霉(*Pythium irregulare*)、德巴利腐霉(*Pythium debaryanum*)、群结腐霉(*Pythiummyriotylum*)、终极腐霉(*Pythium ultimum*))、丝核菌根腐病、茎腐(*stem decay*)和立枯病(立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*))、核盘菌茎腐病(*sclerotinia stem decay*) (核盘菌(*Sclerotinia sclerotiorum*))、核盘菌白绢病(*sclerotinia southern blight*) (*Sclerotinia rolfsii*)、根串珠霉根腐病(*thielaviopsis root rot*) (根串珠霉(*Thielaviopsis basicola*))。

[0255] 本发明的杀真菌剂组合物可治疗性地或保护性/预防性地防治植物病原真菌。因此，本发明还涉及使用本发明的活性成分或组合物防治植物病原真菌的治疗性和保护性方法，本发明的活性成分或组合物被施用于种子、植物或植物部位、果实或植物生长的土壤。

[0256] 植物在防治植物病害所需的浓度下对活性成分具有好的耐受性的事实允许处理植物的地上部分、植物繁殖根株和种子，以及土壤。

[0257] 所有的植物和植物部位都可根据本发明进行处理。在本发明中，植物的含义应理解为表示所有的植物和植物种群，例如需要和不需要的野生植物、栽培种和植物变种(不论

是否受品种权或植物育种者权的保护)。栽培种和植物变种可以是通过一种或多种生物技术法进行辅助或增补的常规繁殖和育种方法获得的植物,所述生物技术法例如通过使用双单倍体、原生质体融合、随机诱变和定向诱变、分子标记或遗传标记,或通过生物工程和遗传工程的方法。植物部位应理解为表示植物所有地上和地下部位和器官,例如芽、叶、花和根,可提及的实例为叶、针叶、茎、枝、花、子实体、果实、种子,以及根、球茎和根茎。植物部位还包括作物以及无性繁殖和有性繁殖材料,例如插条、球茎、根茎、分蘖和种子。

[0258] 当本发明的活性成分具有良好的植物耐受性,具有有利的恒温动物毒性,并且具有良好的环境耐受性时,它们适合用于保护植物和植物器官,从而提高产量,以及提高所收获物质的质量。它们被优选用作作物保护组合物。它们对通常敏感和抗性品种以及对全部或部分的发展阶段具有活性。

[0259] 可依照本发明处理的植物包括以下主要作物植物:玉米、大豆、苜蓿、棉花、向日葵、芸苔油籽(*Brassica oil seeds*)例如甘蓝型油菜(例如加拿大油菜、油菜籽)、芜菁(*Brassica rapa*)、芥菜型油菜(*B. juncea*) (如芥菜)和埃塞俄比亚芥(*Brassica carinata*)、棕榈科(例如油椰子、椰子)、稻、小麦、甜菜、甘蔗、燕麦、黑麦、大麦、粟和高粱、黑小麦、亚麻、坚果、葡萄和藤本植物以及各种水果,及各种植物分类群的蔬菜,例如蔷薇科属(*Rosaceae sp.*) (例如仁果如苹果和梨;以及核果如杏、樱桃、扁桃、李子和桃;浆果如草莓、覆盆子、红醋栗(*red currant*)和黑醋栗(*black currant*),以及醋栗(*gooseberry*))、茶子科属(*Ribesioideae sp.*)、胡桃科属(*Juglandaceae sp.*)、桦木科属(*Betulaceae sp.*)、漆树科属(*Anacardiaceae sp.*)、壳斗科属(*Fagaceae sp.*)、桑科属(*Moraceae sp.*)、木犀科属(*Oleaceae sp.*) (如橄榄树)、猕猴桃科属(*Actinidaceae sp.*)、樟科属(*Lauraceae sp.*) (例如鳄梨、桂皮、樟脑)、芭蕉科属(*Musaceae sp.*) (例如香蕉树和绿化树(*plantations*))、茜草科属(*Rubiaceae sp.*) (例如咖啡)、山茶科属(*Theaceae sp.*) (例如茶树)、梧桐科属(*Sterculiaceae sp.*)、芸香科属(*Rutaceae sp.*) (例如柠檬、橙、柑橘和葡萄柚)、茄科属(*Solanaceae sp.*) (例如番茄、马铃薯、胡椒、辣椒、茄子和烟草)、百合科属(*Liliaceae sp.*)、菊科属(*Compositae sp.*) (例如莴苣、朝鲜蓟和菊苣--包括根菊苣(*root chicory*)、苣荬菜(*endive*)或普通菊苣(*common chicory*))、伞形科属(*Umbelliferae sp.*) (例如胡萝卜、欧芹、芹菜和块根芹)、葫芦科属(*Cucurbitaceae sp.*) (例如黄瓜--包括小黄瓜、南瓜、西瓜、葫芦类和甜瓜类)、葱科属(*Alliaceae sp.*) (例如韭类和洋葱类)、十字花科属(*Cruciferae sp.*) (例如白球甘蓝、红球甘蓝、椰菜、花椰菜、抱子甘蓝、小白菜、球茎甘蓝、萝卜、辣根、水芹和大白菜)、豆科属(*Leguminosae sp.*) (例如花生、豌豆类、扁豆类和菜豆类--例如普通的豆类和广义的豆类)、藜科属(*Chenopodiaceae sp.*) (例如叶甜菜(*Swiss chard*)、饲用甜菜、菠菜、甜菜根)、亚麻科属(*Linaceae sp.*) (例如大麻)、美人蕉科(*Cannabeacea sp.*) (例如大麻)、锦葵科属(*Malvaceae sp.*) (例如黄秋葵、可可)、罂粟科属(*Papaveraceae*) (例如罂粟)、天门冬科(*Asparagaceae*) (例如芦笋);园艺和森林作物中的有用植物和观赏植物,如草皮、草坪、青草和甜叶菊(*Stevia rebaudiana*),以及这些植物各自的基因修饰型。

[0260] 抗性诱导/植物健康和其他效果

[0261] 本发明的活性化合物还可对植物产生潜在的强化作用。因此,它们可用于调动植物的防御以抵抗不想要的微生物的侵袭。

[0262] 在本文中,植物强化(抗性诱导)物质应理解为意指那些能够激活植物的防御系统的物质,使得当随后接种不想要的微生物时,经过处理的植物显示出对这些微生物的相当大程度的抗性。

[0263] 本发明的活性化合物还适合用于增加作物的产量。此外,它们显示出降低的毒性和良好的植物耐受性。

[0264] 此外,在本发明的上下文中,植物生理学效应包括以下几种:

[0265] 非生物胁迫耐受性,包括温度耐受性、干旱耐受性、干旱胁迫后的恢复性、水分利用效率(与降低的水消耗量相关)、水涝耐受性、臭氧胁迫和UV耐受性,对化学品如重金属、盐、杀虫剂(安全剂)等的耐受性。

[0266] 生物胁迫耐受性,包括增加的真菌抗性以及增加的线虫抗性、细菌抗性和病毒抗性。在本发明的上下文中,生物胁迫耐受性优选包括增加的真菌抗性和增加的线虫抗性。

[0267] 增强的植物活力,包括植物健康/植物质量和种子活力,降低的倒伏性,改善的外观,提高的恢复力,改善的绿化效果和改善的光合效率。

[0268] 对植物激素和/或功能酶的影响。

[0269] 对生长调节剂(促进剂)的影响,包括更早的发芽、更好的出苗、更发达的根系和/或改善的根生长、增强的分蘖能力、更多产的分蘖、提早开花、增加的植株高度和/或生物量、缩短的茎、幼株生长的改善、每穗粒数的提高、每平方米穗数的提高、匍匐枝数量和/或花朵数量的提高、提高的收获指数、增大的叶子、更少的死亡基生叶、改善的叶序、提早成熟/提早结果、更均匀地成熟、增加的灌浆持续时间、更好地结果、更大的果实/蔬菜、穗发芽抗性和降低倒伏。

[0270] 增加的产量,指增加每公顷的总生物量、每公顷的产量、粒/果重量、种子大小和/或百升重量以及指增加产品的质量,包括:

[0271] 与大小分布(粒,果实等)相关的改善的可加工性、均匀成熟、谷物水分、更好的碾磨、更好的葡萄酒酿制过程、更好的酿造、增加的果汁产量、可收获性、消化率、沉降值、降落值、荚果稳定性、贮存稳定性,改善的纤维长度/强度/均匀度,青贮饲料喂养的动物的增加的奶和/或肉的质量,适合烹饪和油炸;

[0272] 进一步包括与改善的果实/谷物质量、大小分布(粒、果实等)相关的提高的可销售性;增加的存储/保质期、硬度/柔软度、味道(香气,纹理等)、等级(浆果的大小、形状、数量等)、每束浆果/水果的数量、脆度、鲜度、蜡覆盖面、生理病症的频率、颜色等;

[0273] 进一步包括增加的所需成分,例如蛋白质含量、脂肪酸、油含量、油质量、氨基酸组合物、糖含量、酸含量(pH值)、糖/酸比(白利糖度(Brix))、多酚类、淀粉含量、营养质量、谷蛋白含量/指数、能量含量、味道等;

[0274] 进一步包括降低的不需要成分,例如更少的毒枝菌素、更少的黄曲霉毒素、土腥素(geosmin)水平,酚类香味,漆酶(lacchase)、多酚氧化酶和过氧化物酶,硝酸盐含量等。

[0275] 可持续农业,包括营养物利用率,特别是氮(N)利用率、磷(P)利用率、水分利用率;改善的蒸腾作用、呼吸作用和/或CO₂同化作用;更好的结瘤,改善的钙代谢等。

[0276] 延缓衰老,包括植物生理学的改善,其表现在,例如,在更长的灌浆期,导致更高的产量、更长的植物绿叶着色期,因此包含颜色(绿色化),水分含量,干燥度等。因此,在本发明的上下文中,已发现活性化合物结合物的具体发明应用可以延长绿叶面积持续时间,延

迟植物的成熟(衰老)。对农民而言,其主要优势在于更长灌浆期,从而导致更高产量。对农民而言的另一优势为采收期更具弹性。

[0277] 其中“沉降值”是蛋白质质量的量度,并根据Zeleny (Zeleny值)即在标准时间间隔内悬浮在乳酸溶液中的面粉的沉降程度对其进行描述。这是衡量烘焙质量的标准。面粉中的谷蛋白部分在乳酸溶液中的溶胀影响面粉悬浮液的沉降速率。更高的谷蛋白含量和更好的谷蛋白质量均能引起更慢的沉降和更高的Zeleny测试值。面粉的沉降值取决于小麦蛋白成分,并且主要与蛋白质含量、小麦的硬度及平锅和灶台面包 (hearth loaf) 的体积相关。相比于SDS沉降体积,面包体积 (loaf volume) 和Zeleny沉降体积之间的更强关联可能归因于影响体积与Zeleny值的蛋白质含量 (Czech J. Food Sci. 第21卷, 第3期: 91-96, 2000)。

[0278] 另外如本文提及的“降落值”是谷类、特别是小麦的烘焙质量的量度。降落值测试表明可能已经发生发芽损坏。这意味着小麦粒的淀粉部分的物理性质已经发生了变化。其中,降落值测定仪通过测量面粉和水的糊剂对降落柱塞的阻力来分析粘度。这一现象发生的时间 (以秒为单位) 被称为降落值。降落值结果被记录为小麦或面粉样品中的酶活性的指数,结果以秒为单位的时间进行表示。高降落值 (例如, 300秒以上) 表示最小的酶活性和优质的小麦或面粉。低降落值 (例如, 250秒以下) 表示显著的酶活性和存在发芽损坏的小麦或面粉。

[0279] 术语“更发达的根系”/“改善的根生长”是指更长的根系,更深的根生长、更快的根生长、更高的根干重/鲜重、更大的根体积、更大的根表面积、更大的根直径、更高的根稳定性、更多的根分枝、更多的根毛数量和/或更多的根尖,并且利用合适的方法和图像分析程序 (例如WinRhizo) 通过分析根的体系结构可对其进行测定。

[0280] 术语“作物水分利用率”技术上是指出单位用水量的农业生产质量,经济上是指每单位体积用水量的产品生产体积,例如可通过每公顷产量、植物的生物量、千粒质量和每平方米的穗数量来衡量。

[0281] 术语“氮利用率”技术上是指出单位耗氮量的农业生产质量,经济上指每单位耗氮量的产品生产体积,反应其吸收和利用效率。

[0282] 提高绿色化/改善颜色和提高光合效率以及延缓衰老可以通过已知技术进行测定,例如HandyPea系统 (Hansatech)。Fv/Fm是一种广泛用于表示光系统II (PSII) 的最大量子效率的参数。该参数被广泛认为可选择性指示植物光合性能,健康样品通常达到约0.85的最大Fv/Fm值。如果样品被暴露于某些类型的生物或非生物胁迫因子下 (所述因子降低了PSII中能量的光化学淬灭的能力),可观察到低于此数值的值。Fv/Fm意为可变荧光 (Fv) 相对于最大荧光值 (FM) 之比。性能指标基本上是样品活力的指示。(参见例如Advanced Techniques in Soil Microbiology, 2007, 11, 319-341; Applied Soil Ecology, 2000, 15, 169-182.)

[0283] 提高绿色化/改善颜色和提高光合效率以及延缓衰老还可以通过净光合效率 (Pn) 的测定、叶绿素含量的测定,例如通过齐格勒 (Ziegler) 和埃勒 (Ehle) 的色素提取方法,光化学效率 (Fv/Fm比值) 的测定、幼株生长和最终的根和/或冠层生物量的测定,以及分蘖密度和根死亡率的测定来评估。

[0284] 在本发明的上下文中,优选改善植物生理学效应,所述效应选自增强的根系生长/更发达的根系、提高绿色化、提高的水分利用率 (与降低的水消耗量相关)、提高的营养物利

用率,尤其选自改善的氮(N)利用率、延缓衰老和提高产量。

[0285] 在提高产量中,优选提高沉降值和降落值以及提高蛋白质和糖的含量-尤其是选自谷物的植物(优选小麦)。

[0286] 优选地,本发明的杀真菌剂组合物的新用途涉及a)在有或没有抗性治理(resistance management)的情况下预防性地和/或治疗性地防治病原真菌和/或线虫,和b)增强根系生长、提高绿色化、提高水利用率、延缓衰老和提高产量中的至少一种的结合用途。在b)组中,特别优选增强根系、提高水分利用率和氮利用率。

[0287] 处理种子

[0288] 本发明进一步包括一种处理种子的方法。

[0289] 本发明进一步涉及利用前文所述方法之一处理的种子。在保护种子对抗不想要的微生物的方法中使用本发明的种子。在这些方法中,使用经过至少一种本发明的活性成分处理过的种子。

[0290] 本发明的活性成分或组合物也适用于处理种子。大多数由有害生物引起的作物植物的损害是由种子贮存期间或播种后以及植物发芽期间或发芽后的种子感染引起的。这个阶段特别关键,因为生长植物的根和幼株特别敏感,即使微小的损害也可能导致植物死亡。因此,使用合适的组合物来保护种子和发芽植物引起了极大的关注。

[0291] 通过处理植物种子来防治植物病原真菌长期为人们所知,并且是不断改进的主题。然而,种子的处理产生一系列的问题总是无法以令人满意的方式得到解决。因此,需要开发用于保护种子和发芽植物的方法,其在播种后或植物出苗后无需或至少显著降低作物保护组合物的额外施用。还期望优化所用活性成分的用量,从而为种子和发芽植物提供最大保护使其免于植物病原真菌侵袭,且植物本身也不会受到所用的活性成分的伤害。特别地,处理种子的方法还应考虑转基因植物固有杀真菌特性,以使用最少的作物保护组合物达到对种子和发芽植物的最佳保护。因此,本发明还涉及一种通过使用本发明的组合物处理种子以保护种子和发芽植物免于植物病原真菌侵袭的方法。本发明还涉及本发明组合物用于处理种子以保护种子和发芽植物免于植物病原真菌侵袭的用途。本发明进一步用本发明的组合物处理以抵抗植物病原真菌的种子。

[0292] 损害出苗后的植物的植物病原真菌主要通过用作物保护组合物处理土壤和植物的地上部位来防治。由于考虑到作物保护组合物对环境以及人类和动物健康的可能的影响,所以应努力减少活性成分的用量。

[0293] 本发明的优点之一是:本发明活性成分和组合物的特定的内吸性意味着,使用这些活性成分和组合物处理种子不仅能保护种子本身免受植物病原真菌侵袭,还能保护植物出苗后免受植物病原真菌侵袭。以此方式,可以无需在播种时和播种后立即对作物的即时处理。还被认为有利的是,本发明的活性成分或组合物可特别地被用于转基因种子,其中由该种子长成的植物能够表达抗害虫的蛋白。通过使用本发明活性成分或组合物处理此类种子,仅仅通过蛋白质例如杀虫蛋白质的表达就可防治某些害虫。令人惊讶地,在这种情况下可以观察到另外的协同效应,其可额外提高抵抗害虫侵袭的保护效果。本发明的组合物适合于保护在农业、温室、森林或园艺和葡萄栽培中所使用的任何植物品种的种子。特别地,为以下植物品种的种子:谷类(例如小麦、大麦、黑麦、黑小麦、高粱/粟和燕麦)、玉米、棉花、大豆、稻、马铃薯、向日葵、菜豆、咖啡、甜菜(例如糖用甜菜和饲用甜菜)、花生、油菜、罂粟、

橄榄、椰子、可可树、甘蔗、烟草、蔬菜(例如番茄、黄瓜、洋葱和莴苣)、草坪植物和观赏植物(参见下文)。对于谷物(例如小麦、大麦、黑麦、黑小麦和燕麦)、玉米和稻种子的处理是特别重要的。如下文所述,使用本发明的活性成分或组合物对转基因种子的处理是特别重要的。这涉及包含至少一种异源基因的植物种子。合适的异源基因的定义和实例在下文给出。

[0294] 在本发明的上下文中,本发明的组合物被单独或以合适的制剂形式施用于种子。优选地,种子在足够稳定从而在处理过程中不发生损害的状态下处理。通常,对种子的处理可在采收和播种之间的任何时间进行。所用种子通常已从植物中分离,并已除去穗轴、外壳、茎、荚、绒毛或果肉。例如,可以使用已经采收、清洁并干燥至含水量小于15重量%的种子。或者,也可使用干燥后例如用水处理然后再干燥的种子。

[0295] 当处理种子时,通常必须注意施用于种子的本发明的组合物的量和/或其他添加剂的量是精选的,在这种情况下,种子的发芽不会受损,或所得植物不受损害。特别是在活性成分在某些施用率下可具有植物毒性效应的情况下,必须牢记这点。

[0296] 本发明的组合物可以直接施用,即,不包括其他组分并且未经稀释。通常优选将组合物以合适的制剂形式施用于种子。处理种子的合适的制剂和方法为本领域技术人员已知,并且描述于以下文献中,例如:US 4,272,417 A、US 4,245,432 A、US 4,808,430 A、US 5,876,739、US 2003/0176428 A1、WO 2002/080675、WO 2002/028186。

[0297] 本发明可用的活性成分可转化为常规的拌种制剂,例如溶液、乳剂、悬浮剂、粉剂(powder)、泡沫剂、浆剂(slurries)或其他种子包衣组合物,以及ULV制剂。

[0298] 这些制剂可用已知方法通过将活性成分与常见添加剂(例如常见填充剂以及溶剂或稀释剂、着色剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、消泡剂、防腐剂、二次增稠剂、粘结剂、赤霉素以及水)进行混合而制备。

[0299] 可存在于根据本发明使用的拌种制剂中的有用的着色剂为常用于此目的的所有着色剂。可使用微溶于水的颜料和溶于水的染料。实例包括已知的名称为罗丹明B(Rhodamine B)、C.I.Pigment Red 112和C.I.Solvent Red 1的着色剂。

[0300] 可存在于根据本发明使用的拌种制剂中的有用的润湿剂为可促进润湿并通常用于活性农业化学成分制剂中的所有物质。优选使用萘磺酸烷基酯,如萘磺酸二异丙酯或萘磺酸二异丁酯。

[0301] 可存在于根据本发明使用的拌种制剂中的有用的分散剂和/或乳化剂为常用于活性农业化学成分制剂中的所有非离子、阴离子和阳离子的分散剂。优选使用非离子或阴离子分散剂,或者非离子或阴离子分散剂的混合物。合适的非离子分散剂特别地包括环氧乙烷/环氧丙烷嵌段聚合物、烷基苯酚聚乙二醇醚和三苯乙基苯酚聚乙二醇醚、及其磷酸化或硫酸化衍生物。合适的阴离子分散剂特别为木素磺酸盐、聚丙烯酸盐和芳基磺酸盐/甲醛缩合物。

[0302] 可存在于根据本发明使用的拌种制剂中的有用的消泡剂为常用于活性农业化学成分制剂中的所有泡沫抑制物质。优选使用硅氧烷消泡剂和硬脂酸镁。

[0303] 可存在于根据本发明使用的拌种制剂中的防腐剂为可用于此目的农业化学组合物中的所有物质。实例包括双氯酚和苄醇半缩甲醛。

[0304] 可存在于根据本发明使用的拌种制剂中的二次增稠剂为可用于此目的农业化学组合物中的所有物质。优选实例包括纤维素衍生物、丙烯酸衍生物、黄原胶、改性粘土、以及

细碎的二氧化硅。

[0305] 可存在于根据本发明使用的拌种制剂中的粘结剂为可用于种衣剂产品的所有常见粘合剂。优选实例包括聚乙烯吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇和纤基乙酸钠(tylose)。

[0306] 可存在于根据本发明使用的拌种制剂中的赤霉素优选为赤霉素A1、A3(=赤霉酸)、A4和A7;特别优选使用赤霉酸。所述赤霉素是已知的(参见R.Wegler“Chemie der Pflanzenschutz-und **Schädlingsbekämpfungsmittel**”[Chemistry of the Crop Protection Compositions and Pesticides],第2卷,Springer Verlag,1970,第401-412页)。

[0307] 根据本发明使用的拌种制剂可以直接使用或以水稀释后使用,以处理多种类型的种子,包括转基因植物的种子。在这种情况下,与由表达形成的物质之间的相互作用也会产生额外的协同效应。

[0308] 对于用根据本发明使用的拌种制剂或由其加水制得的制剂进行的种子处理来说,所有常用于拌种的混合单元都是有用的。具体而言,拌种采用的步骤包括将种子引入混合器、加入特定所需量的拌种制剂(以其本身或预先以水稀释后)、然后进行混合直到制剂均匀地分布在种子上。如果合适,之后进行干燥处理。

[0309] 毒枝菌素

[0310] 此外,本发明的处理可以减少所收获的材料以及由此制备的食物和饲料中的毒枝菌素的含量。毒枝菌素特别地但不仅仅包括:脱氧瓜萎镰菌醇(Deoxynivalenol,DON)、瓜萎镰菌醇(Nivalenol)、15-Ac-DON、3-Ac-DON、T2-毒素、HT2-毒素、伏马菌素(fumonisin)、玉米赤霉烯酮(zearalenon)、串珠镰刀菌素(moniliformin)、镰刀菌素(fusarin)、蛇形菌素(diaacetoxyscirpenol,DAS)、白僵菌素(beauvericin)、恩镰孢菌素(enniatin)、层出镰孢菌素(fusaroproliferin)、镰刀菌醇(fusarenol)、赭曲霉毒素(ochratoxin)、棒曲霉素(patulin)、麦角生物碱(ergotalkaloids)和黄曲霉毒素(aflatoxin),这些毒素可由例如以下真菌产生:镰刀霉属(*Fusarium spec.*),例如锐顶镰刀菌(*F.acuminatum*)、*F.asiaticum*、燕麦镰刀菌(*F.avenaceum*)、克地镰刀菌(*F.crookwellense*)、黄色镰孢菌(*F.culmorum*)、禾谷镰刀菌(*F.graminearum*) (玉蜀黍赤霉(*Gibberellazeae*))、水贼镰刀菌(*F.equiseti*)、*F.fujikoroii*、香蕉镰刀菌(*F.musarum*)、尖孢镰刀菌(*F.oxysporum*)、再育镰刀菌(*F.proliferatum*)、梨孢镰刀菌(*F.poa*)、*F.pseudograminearum*、接骨木镰刀菌(*F.sambucinum*)、藤草镰刀菌(*F.scirpi*)、半裸镰刀菌(*F.semitectum*)、腐皮镰刀菌(*F.solafni*)、拟枝孢镰刀菌(*F.sporotrichoides*)、*F.langsethiae*、亚黏团镰刀菌(*F.subglutinans*)、三线镰孢菌(*F.tricinctum*)、串珠镰刀菌(*F.verticillioides*)等;以及曲霉属(*Aspergillus spec.*),例如黄曲霉(*A.flavus*)、寄生曲霉(*A.parasiticus*)、红绶曲霉(*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.*),例如纯绿青霉(*P.verrucosum*)、鲜绿青霉(*P.viridicatum*)、橘青霉(*P.citrinum*)、扩展青霉(*P.expansum*)、棒形青霉(*P.claviforme*)、娑地青霉(*P.roqueforti*);麦角菌属(*Claviceps spec.*),例如紫麦角菌(*C.purpurea*)、纺锤麦角菌(*C.fusiformis*)、雀稗麦角菌(*C.paspali*)、*C.africana*;葡萄状穗霉属(*Stachybotrys spec.*)及其他。

[0311] 材料保护

[0312] 本发明的活性成分或组合物还可用于材料保护,以保护工业材料免于不想要的微生物(例如真菌和昆虫)的侵袭或破坏。

[0313] 此外,本发明的化合物可单独或与其他活性成分一起用作防污组合物。

[0314] 在本发明的上下文中,工业材料应被理解为意指为了工业应用而制备的无生命材料。例如,被本发明的活性成分保护免于微生物的改变或破坏的工业材料可以是粘结剂、胶水、纸张、壁纸、木板/硬纸板、纺织品、地毯、皮革、木材、纤维和薄纱、油漆和塑料制品、冷却润滑剂和其他可被微生物污染或破坏的材料。可能被微生物的增殖损害的生产设备的零件和建筑物(例如冷却水回路,冷却和加热系统、通风和空调设备)也包括在被保护材料的范围内。在本发明范围内的工业材料优选包括粘结剂、胶料(size)、纸和纸片、皮革、木材、油漆、冷却润滑剂和传热流体,更优选木材。

[0315] 本发明的活性成分或组合物可以预防多种不良效果,例如腐烂、腐坏、变色、褪色或发霉。

[0316] 在处理木材时,本发明的化合物/组合物还可用来抵抗易于在木材表面或内部生长的真菌病害。属于“木材”意指所有类型的木材品种,以及所有类型的用于建筑的该木材的加工品(working),例如实木、高密度木材、胶合板(laminated wood)、夹板(plywood)。本发明处理木材的方法主要包括与一种或多种本发明的化合物或本发明的组合物接触;这包括例如直接施用、喷涂、浸渍、注射或任何其他合适的方式。

[0317] 此外,本发明的化合物可用于保护会接触到盐水或苦咸水的物体免受污染,特别是船体(hulls)、筛子(screens)、网(nets)、建筑物、系泊设备和信号系统。

[0318] 本发明的用于防治不想要的微生物的方法还可用于保护贮存物。贮存物应理解为意指植物或动物来源的天然物质或其加工产品(天然来源),其需要长期保护。植物来源的贮存物例如植物或植物的部位(如茎、叶、块茎、种子、果实、谷粒)可在刚收获或通过(预)干燥、润湿、粉碎、研磨、压榨或烘培等加工后进行保护。贮存物还包括未加工的木材例如建筑木材、电线杆和栅栏,或成品形式,例如家具。动物来源的贮存物例如兽皮、皮革、毛皮或毛发。本发明的活性成分可以预防多种不良效果,如腐烂、腐坏、变色、褪色或发霉。

[0319] 能够降解或改变工业材料的微生物包括,例如细菌、真菌、酵母菌、藻类和粘质生物体。本发明的活性成分优选抗真菌,尤其是霉菌、木材变色菌(wood-discoloring fungi)、腐木菌(wood-destroying fungi)(子囊菌(Ascomycetes)、担子菌(Basidiomycetes)、半知菌(Deuteromycetes)和接合菌(Zygomycetes)),以及抗粘质生物体和藻类。实例包括以下属的微生物:链格孢(Alternaria)属,例如细链格孢(Alternaria tenuis);曲霉(Aspergillus)属,例如黑曲霉(Aspergillus niger);毛壳菌(Chaetomium)属,例如球毛壳(Chaetomium globosum);粉孢革菌(Coniophora)属,例如粉孢革菌(Coniophora puetana);香燕菌(Lentinus)属,例如虎皮香燕菌(Lentinus tigrinus);青霉菌(Penicillium)属,例如灰绿青霉(Penicillium glaucum);多孔菌(Polyporus)属,例如变色多孔菌(Polyporus versicolor);短梗霉(Aureobasidium)属,例如出芽短梗霉(Aureobasidium pullulans);核茎点(Sclerophoma)属,例如Sclerophoma pityophila;木霉(Trichoderma)属,例如绿色木霉(Trichoderma viride);长喙壳属(Ophiostoma spp.)、甘薯属(Ceratocystis spp.)、霉属(Humicola spp.)、彼得壳属(Petriella spp.)、毛束霉

属(*Trichurus* spp.)、革盖菌属(*Coriolus* spp.)、粘褶菌属(*Gloeophyllum* spp.)、侧耳属(*Pleurotus* spp.)、卧孔菌属(*Poria* spp.)、干朽菌属(*Serpula* spp.)、干酪菌属(*Tyromyces* spp.)、枝孢菌属(*Cladosporium* spp.)、拟青霉属(*Paecilomyces* spp.)、毛霉属(*Mucor* spp.)、埃希氏菌属(*Escherichia*),如大肠杆菌(*Escherichia coli*);假单胞菌属(*Pseudomonas*),例如绿脓假单胞菌(*Pseudomonas aeruginosa*);葡萄球菌属(*Staphylococcus*),例如金黄色酿脓葡萄球菌(*Staphylococcus aureus*);假丝酵母属(*Candida* spp),以及酵母属(*Saccharomyces* spp),例如酿酒酵母(*Saccharomyces cerevisiae*)。

[0320] 抗真菌活性

[0321] 此外,本发明的活性成分 also 具有很好的抗真菌活性。它们具有很宽的抗真菌活性谱,特别是抗皮肤癣菌和酵母菌、霉菌和双相型真菌(例如抗念珠菌属(*Candida* species),如白色念珠菌(*C.albicans*)和光滑念珠菌(*C.glabrata*)),以及絮状表皮癣菌(*Epidermophyton floccosum*)、曲霉属(*Aspergillus* species)(例如黑霉菌(*A.niger*)和烟曲霉(*A.fumigatus*))、毛癣菌属(*Trichophyton* species)(例如须毛癣菌(*T.mentagrophytes*))、小孢子菌属(*Microsporon* species)(例如大小孢子菌(*M.canis*)和奥杜安氏小孢子菌(*M.audouinii*))。列举这些真菌并不构成对真菌覆盖范围的限制,而仅仅用来示例。

[0322] 因此,本发明的活性成分可用于医药应用和非医药应用。

[0323] GMO

[0324] 如上所述,可以根据本发明治疗所有植物和植物部位。在一个优选实施方案中,对野生植物物种和植物栽培种或那些通过传统生物育种方法(例如交叉或原生质体融合)获得的植物及其部位进行处理。在另一优选实施方案中,对转基因植物和通过遗传工程方法(如果合适与传统方法相结合(遗传修饰生物))获得的植物栽培种及其部位进行处理。术语“部位”或“植物的部位”或“植物部位”已在上文作出解释。更优选地,市售的或在使用中的植物栽培种的植物均根据本发明进行处理。植物栽培种应理解为意指通过传统育种方法、诱变或重组DNA技术获得的具有新特性(“特点”)的植物。它们可以是栽培种、变种、生物型或基因型。

[0325] 本发明的处理方法可用于处理遗传修饰生物(GMOs),例如植物或种子。遗传修饰植物(或转基因植物)是异源基因被稳定地整合到基因组中的植物。术语“异源基因”基本上意指在植物体外部提供或组装的基因,当其被引入到细胞核、叶绿体或线粒体的基因组时,通过表达目的蛋白或多肽或通过下调或使其他存在于植物中的基因沉默(利用例如反义技术、共抑制技术、RNA干扰-RNAi-技术或microRNA-miRNA-技术)可赋予基因转移植物新的或是改进的农学特性或其他特性。位于基因组中的异源基因也称为转基因。由其在植物基因组中的具体位置限定的转基因称为转化株系(transformation event)或转基因株系(transgenic event)。

[0326] 根据植物物种或植物栽培种、它们的位置和生长条件(土壤、气候、营养期、营养),本发明的处理还可导致超加性(“协同”)效应。因此,例如,可能出现以下超过实际预期的效果:可根据本发明使用的活性化合物和组合物的降低的施用率和/或拓宽的活性谱和/或增加的活性、改善的植物生长、提高的高温或低温耐受性、提高的干旱或水或土壤含盐度的耐

受性、提高的开花性能、更容易采收、加速成熟、更高的产量、更大的果实、更高的植物高度、更绿的叶子颜色、更早的开花、更高的所收获产品的质量和/或营养价值、果实中更高的糖浓度、更好的所获产品的贮存稳定性和/或可加工性。

[0327] 在某些施用率下,本发明的活性化合物结合物还可对植物产生增强作用。因此,它们还适合调动植物的防御系统植物以抵抗不想要的微生物。如果合适,这可能是本发明结合物的活性(例如抗真菌活性)增强的原因之一。在本文中,植物强化(抗性诱导)物质应理解为意指那些能够刺激植物的防御系统的物质或物质的结合,以便当随后接种不想要的微生物时,处理过的植物显示出对这些微生物相当大程度的抗性。在本文中,不想要的微生物应理解为意指植物病原真菌、细菌和病毒。因此,本发明的物质可用于在处理后的一段时间内保护植物免受上述病原体的侵袭。在用活性化合物处理植物后,提供保护的时间通常可以维持1-10天,优选1-7天。

[0328] 优选根据本发明处理的植物和植物栽培种包括具有能够赋予这些植物(无论是否通过育种和/或生物技术手段获得)特别有利、有用的特性的遗传物质的所有植物。

[0329] 优选根据本发明处理的植物和植物栽培种对一种或多种生物胁迫因素具有抗性,即,所述植物对动物和微生物害虫具有更好的抵抗力,所述微生物害虫例如线虫、昆虫、螨类、植物病原真菌、细菌、病毒和/或类病毒。

[0330] 抗线虫和昆虫的植物的实例描述于美国专利申请11/765,491、11/765,494、10/926,819、10/782,020、12/032,479、10/783,417、10/782,096、11/657,964、12/192,904、11/396,808、12/166,253、12/166,239、12/166,124、12/166,209、11/762,886、12/364,335、11/763,947、12/252,453、12/209,354、12/491,396、12/497,221、12/644,632、12/646,004、12/701,058、12/718,059、12/721,595、12/638,591中。

[0331] 还可根据本发明处理的植物和植物栽培种为那些对一种或多种非生物胁迫因素具有抗性的植物。非生物胁迫条件可包括,例如干旱、低温暴露、热暴露、渗透胁迫、水涝、提高的土壤含盐度、增强的矿物暴露、臭氧暴露、强光暴露、有限的氮营养素利用度、有限的磷营养素利用度、避荫。

[0332] 还可根据本发明处理的植物和植物栽培种为那些以提高的产量特性为特征的植物。所述植物提高的产量可以是以下因素的结果:例如,改良的植物生理机能、生长和发育例如水分利用率、水分保留率、提高的氮利用、增强的碳同化作用、增强的光合作用、提高的发芽率和加速成熟。此外,产量还受改进的植物体系结构(plant architecture)(在胁迫和非胁迫条件下)的影响,所述植物体系结构包括但不限于,提早开花、对杂交种子生产的开花控制、秧苗活力、植株大小、节间数和节间距、根系生长、种子大小、果实大小、荚果大小、荚果数或穗数、每个荚果或穗的种子数量、种子质量、增强的种子饱满度、减少的种子传播、减少的荚果开裂以及抗倒伏。其他的产量特征包括种子组成,如碳水化合物含量、蛋白质含量、油含量和组成、营养价值、抗营养化合物的降低、改善的加工性和更好的贮存稳定性。可根据本发明处理的植物为已表达出杂种优势或杂种活力的特性的杂种植物,所述特性通常会导致更高的产量、活力、健康度和对生物和非生物胁迫的抵性。此类植物通常由一种自交雄性不育亲系(母系)与另一种自交雄性能育亲系(父系)杂交而制得。杂种种子通常从雄性不育植株中采收并售给栽培者。雄性不育植株有时(例如玉米)可通过去雄花穗(即机械去除雄性生殖器官或雄花)而制得,但是,更通常地,雄性不育性由植物基因组中的遗

传决定因子产生。在这种情况下,尤其是当希望从杂种植株采收的产品是种子时,确保杂种植株的雄性能育性的完全恢复通常是有用的,所述杂种植株含有造成雄性不育性的遗传决定因子。这可通过确保父系具有合适的能够恢复杂种植株的雄性能育性的育性恢复基因而实现,所述杂种植株含有造成雄性不育的遗传决定因子。雄性不育的遗传决定因子可以位于细胞质中。细胞质雄性不育(CMS)的实例为例如描述于芸苔属种(*Brassica species*) (WO 92/05251、WO 95/09910、WO 98/27806、W005/002324、WO 06/021972和US 6,229,072)中。然而,雄性不育遗传决定因子可位于核基因组中。雄性不育植株也可通过植物生物技术方法例如遗传工程获得。获取雄性不育植株的特别有用的方法记载于WO 89/10396中,其中例如核糖核酸酶如芽孢杆菌RNA酶在雄蕊的绒毡层细胞中进行选择性地表达。然后能育性可通过核糖核酸酶抑制剂例如芽孢杆菌RNA酶抑制剂在绒毡层细胞中的表达而恢复(例如WO 91/002069)。

[0333] 可根据本发明处理的植物或植物栽培种(通过植物生物技术方法例如遗传工程而获得)是除草剂耐受性植物,即,对一种或多种给定的除草剂具有耐受性的植物。这些植物可以通过遗传转化或通过选择含有赋予所述除草剂耐受性的突变的植物而获得。除草剂耐受性植物例如草甘膦(glyphosate)耐受性植物,即对除草剂草甘膦及其盐耐受的植物。植物可以通过不同的方法对草甘膦具有耐受性。例如,草甘膦耐受性植物可通过利用编码5-烯醇丙酮莽草酸-3-磷酸合成酶(5-enolpyruvylshikimate-3-phosphate synthase)(EPSPS)的基因转化植物而获得。所述EPSPS基因的实例为鼠伤寒沙门氏菌(*Salmonella typhimurium*)细菌的AroA基因(突变体CT7)(*Science* 1983,221,370-371)、农杆菌属种(*Agrobacterium sp.*)细菌的CP4基因(*Curr.Topics Plant Physiol.*1992,7,139-145)、编码矮牵牛(*petunia*)EPSPS的基因(*Science*1986,233,478-481)、编码番茄EPSPS的基因(*J.Biol.Chem.*1988,263,4280-4289)或编码牛筋草属(*Eleusine*)EPSPS的基因(WO 01/66704)。所述EPSPS基因也可以是例如EP 0837944、WO 00/66746、WO 00/66747或WO 02/26995中所述的突变的EPSPS。草甘膦耐受性植物还可通过表达编码草甘膦氧化还原酶的基因而获得,正如US 5,776,760和US 5,463,175中所记载。草甘膦耐受性植物还可通过表达编码草甘膦乙酰基转移酶的基因而获得,例如描述于WO 02/036782、WO 03/092360、WO 2005/012515和WO 2007/024782中。草甘膦耐受性植物还可通过选择含有天然发生上述基因的突变的植物而获得,例如描述于WO 01/024615或WO 03/013226中。表达可赋予草甘膦耐受性的EPSPS基因的植物描述于例如美国专利申请11/517,991、10/739,610、12/139,408、12/352,532、11/312,866、11/315,678、12/421,292、11/400,598、11/651,752、11/681,285、11/605,824、12/468,205、11/760,570、11/762,526、11/769,327、11/769,255、11/943801或12/362,774中。包含其他可赋予草甘膦耐受性的基因(例如脱羧酶基因)的植物描述于例如美国专利申请11/588,811、11/185,342、12/364,724、11/185,560或12/423,926中。

[0334] 其他除草剂耐受性植物为例如对抑制谷氨酰胺合成酶的除草剂(例如双丙氨膦(bialaphos)、草丁膦(phosphinothricin)或草铵膦(glufosinate))具有耐受性的植物。这些植物可通过表达解毒除草剂的酶或对抑制作用有耐受性的谷氨酰胺合成酶突变体而获得,例如描述于美国专利申请11/760,602中。一种所述的有效解毒酶为编码草丁膦乙酰转移酶的酶(例如链霉菌(*Streptomyces*)属中的bar或pat蛋白)。表达外源性草丁膦乙酰基转

移酶的植物描述于例如美国专利5,561,236、5,648,477、5,646,024、5,273,894、5,637,489、5,276,268、5,739,082、5,908,810和7,112,665中。

[0335] 其他的除草剂耐受性植物也可以是对抑制羟苯丙酮酸双加氧酶 (HPPD) 的除草剂具有耐受性的植物。HPPD是催化对羟苯基丙酮酸盐 (HPP) 转化为尿黑酸的反应的酶。对HPPD-抑制剂有耐受性的植物可用编码天然存在的抗性HPPD酶的基因或者编码突变或嵌合HPPD酶的基因进行转化,正如WO 96/38567、WO 99/24585、WO 99/24586、WO 09/144079、WO 02/046387或US 6,768,044中所记载。对HPPD抑制剂的耐受性还可通过用编码某些尽管通过HPPD抑制剂对天然HPPD酶具有抑制作用但能够形成尿黑酸的酶的基因对植物进行转化而获得,这类植物和基因描述于WO 99/34008和WO 02/36787中。植物对HPPD抑制剂的耐受性除用编码HPPD耐受性酶的基因外,还可通过用编码具有预苯酸脱氢酶 (PDH) 活性的基因对植物进行转化来改进,正如WO 04/024928中所记载。此外,通过向植物的基因组中导入编码能够代谢或降解HPPD抑制剂的酶(例如WO 2007/103567和WO 2008/150473中所记载的CYP450酶)的基因,可使植物可以对HPPD抑制剂类除草剂具有更好的耐受性。

[0336] 其他的除草剂耐受性植物为耐受乙酰乳酸合成酶 (ALS) 抑制剂的植物。已知的ALS-抑制剂包括,例如,磺酰脲、咪唑啉酮、三唑并嘧啶、嘧啶氧(硫)基苯甲酸酯类(pyrimidinoyoxy(thio)benzoates)和/或磺酰基氨羧基三唑啉酮(sulfonylaminocarbonyltriazolinone)除草剂。已知ALS酶(也称为乙酰羟酸合成酶,AHAS)的不同突变赋予不同除草剂和除草剂组耐受性,例如描述于Tranel and Wright (Weed Science 2002, 50, 700-712),以及美国专利5,605,011、5,378,824、5,141,870和5,013,659中。磺酰脲耐受性植物和咪唑啉酮耐受性植物的生产描述于美国专利5,605,011、5,013,659、5,141,870、5,767,361、5,731,180、5,304,732、4,761,373、5,331,107、5,928,937、5,378,824和WO 96/33270中。其他的咪唑啉酮耐受植物描述于例如WO 2004/040012、WO 2004/106529、WO 2005/020673、WO 2005/093093、WO 2006/007373、WO 2006/015376、WO 2006/024351和WO 2006/060634中。其他的磺酰脲耐受植物和咪唑啉酮耐受性植物还描述于例如WO 2007/024782和美国专利申请61/288958中。

[0337] 其他对咪唑啉酮和/或磺酰脲具有耐受性的植物可通过诱变、在除草剂存在的情况下进行细胞培养选择或者诱变育种而获得,例如US 5,084,082中对大豆,WO 97/41218中对稻,US 5,773,702和WO 99/057965中对甜菜,US 5,198,599中对莴苣或WO 01/065922中对向日葵进行的描述。

[0338] 还可根据本发明处理的植物或植物栽培种(通过植物生物技术方法例如遗传工程获得)为具有昆虫抗性的转基因植物,即,对某些目标昆虫的侵袭具有抗性的植物。这些植物可通过遗传转化或通过选择包含赋予所述昆虫抗性的突变的植物而获得。

[0339] 本文所用“具有昆虫抗性的转基因植物”包括含有至少一种包含编码以下蛋白的编码序列的转基因的任何植物:

[0340] 1) 苏云金杆菌 (*Bacillus thuringiensis*) 的杀虫晶体蛋白或其杀虫部分,例如由Crickmore等人所列举的(1998, Microbiology and Molecular Biology Reviews, 62: 807-813)、Crickmore等人(2005)在苏云金杆菌毒素命名法(在线: http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/)中所更新的杀虫晶体蛋白或其杀虫部分,例如Cry蛋白类Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry2Ab、Cry3Ae或Cry3Bb的蛋白或其杀虫部

分(例如EP-A 1 999 141和WO 2007/107302);或者由合成基因编码的这种蛋白质,例如描述于美国专利申请12/249,016中;或

[0341] 2) 苏云金杆菌晶体蛋白或其一部分,该部分在苏云金杆菌的另一种其它晶体蛋白或其一部分——例如由Cry34和Cry35晶体蛋白组成的二元毒素(Nat.Biotechnol.2001, 19,668-72;Applied Environm.Microbiol.2006,71,1765-1774)或由Cy1A或Cy1F蛋白和Cy2Aa或Cy2Ab或Cy2Ae蛋白组成的二元毒素(美国专利申请号12/214,022和EP-A 2 300 618)——的存在下具有杀虫活性;或

[0342] 3) 包含苏云金杆菌的不同杀虫晶体蛋白部分的杂种杀虫蛋白,例如上述1)的蛋白的杂种或上述2)的蛋白的杂种,例如由MON98034玉米株系产生的Cry1A.105蛋白(WO 2007/027777);或

[0343] 4) 上述1)到3)中任一项的蛋白,其中一些氨基酸、特别是1-10个氨基酸已经被另一种氨基酸取代以获得对目标昆虫种类更高的杀虫活性和/或扩展所作用的目标昆虫种类的范围和/或由于在克隆或转化过程中引起编码DNA中的改变,例如在MON863或MON88017玉米株系中的Cry3Bb1蛋白、或MIR604玉米株系中的Cry3A蛋白;或

[0344] 5) 苏云金杆菌或蜡状芽孢杆菌(*Bacillus cereus*)的杀虫分泌蛋白或其杀虫部分,例如下列网址中所列的营养期杀虫蛋白(VIP):http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html,例如VIP3Aa蛋白类的蛋白;或

[0345] 6) 苏云金杆菌或蜡状芽孢杆菌的分泌蛋白,该蛋白,在苏云金杆菌或蜡状芽孢杆菌的另一种分泌蛋白——例如由VIP1A和VIP2A蛋白构成的二元毒素——的存在下具有杀虫活性(WO 94/21795);或

[0346] 7) 包含来自苏云金杆菌或蜡状芽孢杆菌的不同分泌蛋白的部分的杂种杀虫蛋白,例如上述1)的蛋白的杂种或上述2)的蛋白的杂种;或

[0347] 8) 上述5)到7)任一项的蛋白,其中一些氨基酸、特别是1-10个氨基酸已经被另一种氨基酸取代以获得对目标昆虫种类更高的杀虫活性,和/或扩展所作用的目标昆虫种类的范围和/或由于在克隆或转化过程中引起编码DNA中的改变(同时仍编码一种杀虫蛋白),例如在棉花株系COT102中的VIP3Aa蛋白;或

[0348] 9) 苏云金杆菌或蜡状芽孢杆菌的分泌蛋白质,该蛋白在苏云金杆菌的晶体蛋白——例如由VIP3和Cry1A或Cry1F组成的二元毒素(美国专利申请US 61/126083和61/195019)或由VIP3蛋白和Cry2Aa或Cry2Ab或Cry2蛋白组成的二元毒素(美国专利申请US 12/214,022和EP-A 2 300 618)——的存在下具有杀虫活性;

[0349] 10) 上述9)的一种蛋白,其中一些氨基酸、特别是1-10个氨基酸已经被另一种氨基酸取代以获得对目标昆虫种类更高的杀虫活性和/或扩展所作用的目标昆虫种类的范围和/或由于在克隆或转化过程中引起编码DNA中的改变(同时仍编码一种杀虫蛋白)。

[0350] 当然,本文所用具有昆虫抗性的转基因植物还包括含有编码上述1-10类中任一项的蛋白的基因的组合的任何植物。在一个实施方案中,昆虫抗性植物含有不止一种编码上述1-10类中任一项的蛋白的转基因,从而扩展所作用的目标昆虫种类的范围(当使用靶向不同目标昆虫种类的不同蛋白时)或通过使用对相同目标昆虫种类具有杀虫活性但作用模式不同(例如结合至昆虫的不同受体结合位点)的不同蛋白来延迟植物的昆虫抗性的发展。本文所用“具有昆虫抗性的转基因植物”进一步包括含有至少一种转基因的任何植物,该转

基因包含在表达时产生双链RNA的序列,该双链RNA被植物害虫摄入后可抑制这种害虫的生长,例如描述于WO 2007/080126、WO 2006/129204、WO 2007/074405、WO 2007/080127和WO 2007/035650中。

[0351] 还可根据本发明方法处理的植物或植物栽培种(通过植物生物技术方法如遗传工程获得)对非生物胁迫因素具有耐受性。这类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予所述胁迫耐受性的突变的植物而获得。特别有用的胁迫耐受性植物包括:

[0352] 1) 含有能够降低植物细胞或植物中多腺苷二磷酸(ADP)核糖聚合酶(PARP)基因的表达和/或其活性的转基因植物,如WO 00/04173、WO 2006/045633、EP-A 1 807 519或EP-A 2 018 431中所述。

[0353] 2) 含有能够降低植物或植物细胞的PARG编码基因的表达和/或其活性的胁迫耐受性增强转基因的植物,如WO 2004/090140中所述。

[0354] 3) 含有编码烟酰胺腺嘌呤二核苷酸补救合成途径的植物功能酶的胁迫耐受性增强转基因的植物,所述植物功能性酶包括烟酰胺酶、烟酸酯磷酸核糖基转移酶、烟酸单核苷酸腺嘌呤基转移酶、烟酰胺腺嘌呤二核苷酸合成酶或烟酰胺磷酸核糖基转移酶,如EP-A 1 794 306、WO 2006/133827、WO 2007/107326、EP-A 1 999 263或WO 2007/107326中所述。

[0355] 还可根据本发明处理的植物或植物栽培种(通过植物生物技术方法如遗传工程获得)显示出改变的收获产品的数量、质量和/或贮存稳定性,和/或改变的收获产品的具体成分的性质,例如:

[0356] 1) 合成改性淀粉的转基因植物,该改性淀粉的物理化学特性,特别是直链淀粉的含量或直链淀粉/支链淀粉比例、支化程度、平均链长、侧链分布、粘度特性、凝胶化强度、淀粉粒大小和/或淀粉粒形态,与野生型植物细胞或植物中的合成淀粉相比发生了改变,从而使得此改性淀粉更适于特定的应用。所述的合成改性淀粉的转基因植物在例如EP-A 0 571 427、WO 95/04826、EP-A 0 719 338、WO 96/15248、WO 96/19581、WO 96/27674、WO 97/11188、WO 97/26362、WO 97/32985、WO 97/42328、WO 97/44472、WO 97/45545、WO 98/27212、WO 98/40503、WO 99/58688、WO 99/58690、WO 99/58654、WO 00/08184、WO 00/08185、WO 00/08175、WO 00/28052、WO 00/77229、WO 01/12782、WO 01/12826、WO 02/101059、WO 03/071860、WO 04/056999、WO 05/030942、WO 2005/030941、WO 2005/095632、WO 2005/095617、WO 2005/095619、WO 2005/095618、WO 2005/123927、WO 2006/018319、WO 2006/103107、WO 2006/108702、WO 2007/009823、WO 00/22140、WO 2006/063862、WO 2006/072603、WO 02/034923、WO 2008/017518、WO 2008/080630、WO 2008/080631、WO 2008/090008、WO 01/14569、WO 02/79410、WO 03/33540、WO 2004/078983、WO 01/19975、WO 95/26407、WO 96/34968、WO 98/20145、WO 99/12950、WO 99/66050、WO 99/53072、US 6,734,341、WO 00/11192、WO 98/22604、WO 98/32326、WO 01/98509、WO 01/98509、WO 2005/002359、US 5,824,790、US 6,013,861、WO 94/04693、WO 94/09144、WO 94/11520、WO 95/35026、WO 97/20936、WO 2010/012796、WO 2010/003701中进行了公开。

[0357] 2) 合成非淀粉碳水化合物聚合物的转基因植物,或合成与未进行遗传修饰的野生型植物相比具有改变的性质的非淀粉碳水化合物聚合物的转基因植物。实例是产生多聚果糖,尤其是产生菊粉型和果聚糖型多聚果糖的植物,如EP-A 0 663 956、WO 96/01904、WO 96/21023、WO 98/39460和WO 99/24593中所公开;产生 α -1,4-葡聚糖的植物,如WO 95/

31553、US 2002031826、US 6,284,479、US 5,712,107、WO 97/47806、WO 97/47807、WO 97/47808和WO 00/14249中所公开；产生 α -1,6支化 α -1,4-葡聚糖的植物，如WO 00/73422中所公开；以及产生alternan的植物，如WO 00/47727、WO 00/73422、US 5,908,975和EP-A 0 728 213中所公开。

[0358] 3) 产生透明质酸(hyaluronan)的转基因植物，如WO 2006/032538、WO 2007/039314、WO 2007/039315、WO 2007/039316、JP-A 2006-304779和WO 2005/012529中所公开。

[0359] 4) 转基因植物或杂交植物，例如特征为如“高可溶性固体含量”、“低刺激性”(LP)和/或“长期贮存性”(LS)的洋葱，如美国专利申请号12/020,360中所描述。

[0360] 还可根据本发明处理的植物或植物栽培种(通过植物生物技术方法如遗传工程获得)为具有改变的纤维特性的植物，例如棉花植物。这类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予所述改变的纤维特性的突变的植物而获得，包括：

[0361] a) 含有形式改变的纤维素合成酶基因的植物，如棉花植株，如WO 98/00549中所描述。

[0362] b) 含有形式改变的rsw2或rsw3同源核酸的植物，如棉花植株，如WO 2004/053219中所描述。

[0363] c) 具有增加的蔗糖磷酸酯合成酶表达的植物，如棉花植株，如WO 01/17333中所描述。

[0364] d) 具有增加的蔗糖合成酶表达的植物，如棉花植株，如WO 02/45485中所描述。

[0365] e) 其中纤维细胞基部胞间连丝门控的时间(timing)通过例如纤维选择性 β -1,3-葡聚糖酶的下调被改变的植物，如棉花植株，如WO 2005/017157或WO 2009/143995中所描述。

[0366] f) 具有反应性改变的——通过例如含nodC的N-乙酰葡萄糖胺转移酶基因和几丁质合成酶基因的表达而改变——纤维的植物，如棉花植株，如WO 2006/136351中所描述。

[0367] 还可根据本发明处理的植物或植物栽培种(通过植物生物技术方法如遗传工程获得)是具有改变的油分布特性的植物，例如油菜或相关的芸苔属(Brassica)植物。这类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予所述改变的油特性的突变的植物而获得，包括：

[0368] a) 产生具有高油酸含量的油的植物，例如油菜植株，例如US 5,969,169、US 5,840,946或US 6,323,392或US 6,063,947中所描述。

[0369] b) 产生具有低亚麻酸含量的油的植物，例如油菜植物，例如US 6,270,828、US 6,169,190或US 5,965,755中所描述。

[0370] c) 产生具有低水平的饱和脂肪酸的油的植物，例如油菜植株，例如US 5,434,283或美国专利申请号12/668303中所描述。

[0371] 还可根据本发明处理的植物或植物栽培种(通过植物生物技术方法如遗传工程获得)是具有改变的种子散布特性的植物，例如油菜或相关的芸苔属(Brassica)植株。这类植物可通过遗传转化或通过选择含有赋予所述改变的种子散布特性的突变的植物而获得，包括具有延迟或降低的种子散布特性的油菜植株，如美国专利申请号61/135,230、WO 2009/068313和WO 2010/006732中所描述。

[0372] 还可根据本发明处理的植物或植物栽培种(通过植物生物技术方法如遗传工程获

得)是具有改变的蛋白质后修改模式的植物,例如烟草植株,例如WO 2010/121818和WO 2010/145846中所描述。

[0373] 可根据本发明处理的特别有用的转基因植物是包含转化株系或转化株系组合的植物,其在美国为向美国农业部 (USDA) 动植物卫生检验署 (APHIS) 申请非管制状态的主题,无论该申请是否已被批准或仍悬而未决。在任何时候都可从APHIS (4700 River Road, Riverdale, MD 20737, USA) 处容易地获取该信息,例如它的网站 (URL http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html) 中获得。在本申请的提交日,在APHIS处悬而未决或已由APHIS批准的非管制状态申请为表B中列出的那些,其中包含下列信息:

[0374] -申请:申请的识别号码。通过该申请号码,可从APHIS处 (例如在APHIS网站上) 获得的各申请文件中找到对转化株系的技术描述。所述描述以引用的方式纳入本文中。

[0375] -申请的延长:引用延长申请所针对的原申请。

[0376] -机构:提交该申请的实体的名称。

[0377] -所管制的物质:所关注的植物种类。

[0378] -转基因表型:由所述转化株系赋予所述植物的特性。

[0379] -转化株系或转化系:要求非管制状态的一个或多个株系 (有时也称为一个或多个系) 的名称。

[0380] -APHIS文件:由APHIS公布的有关所述申请的各种文件和可向APHIS请求的各种文件。

[0381] 其他特别有用的含有单一转化株系或转化株系组合的植物列于例如多个国家或地区管理机构的数据库中 (参见,例如http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx和<http://www.agbios.com/dbase.php>)。

[0382] 可根据本发明处理的特别有用的转基因植物是含有转化株系或转化株系组合的植物,它们列于例如许多国家或地区管理机构的数据库中,包括株系 (Event) 1143-14A (棉花,昆虫防治,未保藏,描述于WO2006/128569中);株系1143-51B (棉花,昆虫防治,未保藏,描述于WO2006/128570中);株系1445 (棉花,除草剂耐受性,未保藏,描述于US-A 2002-120964或WO02/034946中);株系17053 (稻,除草剂耐受性,保藏为PTA-9843,描述于WO2010/117737中);株系17314 (稻,除草剂耐受性,保藏为PTA-9844,描述于WO2010/117735中);株系281-24-236 (棉花,昆虫防治-除草剂耐受性,保藏为PTA-6233,描述于WO2005/103266或US-A 2005-216969中);株系3006-210-23 (棉花,昆虫防治-除草剂耐受性,保藏为PTA-6233,描述于US-A 2007-143876或WO2005/103266中);株系3272 (玉米,质量特点,保藏为PTA-9972,描述于WO2006/098952或US-A 2006-230473中);株系40416 (玉米,昆虫防治-除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-11508,描述于WO2011/075593中);株系43A47 (玉米,昆虫防治-除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-11509,描述于WO2011/075595中);株系5307 (玉米,昆虫防治,保藏为ATCC PTA-9561,描述于WO2010/077816中);株系ASR-368 (糠稷草 (bent grass),除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-4816,描述于US-A 2006-162007或WO2004/053062中);株系B16 (玉米,除草剂耐受性,未保藏,描述于US-A 2003-126634中);株系BPS-CV127-9 (大豆,除草剂耐受性,保藏为NCIMB No. 41603,描述于WO2010/080829中);株系CE43-67B (棉花,昆虫防治,保藏为DSM ACC2724,描述于US-A 2009-217423或WO2006/128573中);株系CE44-69D (棉花,昆虫防治,未保藏,描述于US-A 2010-0024077中);株系CE44-69D (棉花,

昆虫防治,未保藏,描述于W02006/128571中);株系CE46-02A(棉花,昆虫防治,未保藏,描述于W02006/128572中);株系COT102(棉花,昆虫防治,未保藏,描述于US-A 2006-130175或W02004/039986中);株系COT202(棉花,昆虫防治,未保藏,描述于US-A 2007-067868或W02005/054479中);株系COT203(棉花,昆虫防治,未保藏,描述于W02005/054480中);株系DAS40278(玉米,除草剂耐受性,保藏为ATCCPTA-10244,描述于W02011/022469中);株系DAS-59122-7(玉米,昆虫防治-除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA 11384,描述于US-A 2006-070139中);株系DAS-59132(玉米,昆虫防治-除草剂耐受性,未保藏,描述于W02009/100188中);株系DAS68416(大豆,除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-10442,描述于W02011/066384或W02011/066360中);株系DP-098140-6(玉米,除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-8296,描述于US-A 2009-137395或W02008/112019中);株系DP-305423-1(大豆,品质性,未保藏,描述于US-A 2008-312082或W02008/054747中);株系DP-32138-1(玉米,杂交体系,保藏为ATCC PTA-9158,描述于US-A 2009-0210970或W02009/103049中);株系DP-356043-5(大豆,除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-8287,描述于US-A 2010-0184079或W02008/002872中);株系EE-1(茄子(brinjal),昆虫防治,未保藏,描述于W02007/091277中);株系FI117(玉米,除草剂耐受性,保藏为ATCC 209031,描述于US-A 2006-059581或W0 98/044140中);株系GA21(玉米,除草剂耐受性,保藏为ATCC 209033,描述于US-A 2005-086719或W0 98/044140中);株系GG25(玉米,除草剂耐受性,保藏为ATCC 209032,描述于US-A 2005-188434或W0 98/044140中);株系GHB119(棉花,昆虫防治-除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-8398,描述于W0 2008/151780中);株系GHB614(棉花,除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-6878,描述于US-A 2010-050282或W0 2007/017186中);株系GJ11(玉米,除草剂耐受性,保藏为ATCC 209030,描述于US-A 2005-188434或W0 98/044140中);株系GM RZ13(糖用甜菜,抗病毒,保藏为NCIMB-41601,描述于W0 2010/076212中);株系H7-1(糖用甜菜,除草剂耐受性,保藏为NCIMB 41158或NCIMB 41159,描述于US-A 2004-172669或W0 2004/074492中);株系JOPLIN1(小麦,病害耐受性,未保藏,描述于US-A 2008-064032中);株系LL27(大豆,除草剂耐受性,保藏为NCIMB41658,描述于W0 2006/108674或US-A 2008-320616中);株系LL55(大豆,除草剂耐受性,保藏为NCIMB 41660,描述于W0 2006/108675或US-A 2008-196127中);株系LLcotton25(棉花,除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-3343,描述于W0 03/013224或US-A 2003-097687中);株系LLRICE06(稻,除草剂耐受性,保藏为ATCC-23352,描述于US6,468,747或W0 00/026345中);株系LLRICE601(稻,除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-2600,描述于US-A 2008-2289060或W0 00/026356中);株系LY038(玉米,品质性,保藏为ATCC PTA-5623,描述于US-A 2007-028322或W0 2005/061720中);株系MIR162(玉米,昆虫防治,保藏为PTA-8166,描述于US-A 2009-300784或W0 2007/142840中);株系MIR604(玉米,昆虫防治,未保藏,描述于US-A 2008-167456或W0 2005/103301中);株系MON15985(棉花,昆虫防治,保藏为ATCC PTA-2516,描述于US-A 2004-250317或W0 02/100163中);株系MON810(玉米,昆虫防治,未保藏,描述于US-A 2002-102582中);株系MON863(玉米,昆虫防治,保藏为ATCC PTA-2605,描述于W0 2004/011601或US-A 2006-095986中);株系MON87427(玉米,控制授粉,保藏为ATCC PTA-7899,描述于W0 2011/062904中);株系MON87460(玉米,胁迫耐受性,保藏为ATCC PTA-8910,描述于W0 2009/111263或US-A 2011-0138504中);株系MON87701(大豆,昆虫防治,保藏为ATCC PTA-8194,描述于US-A 2009-130071或W0 2009/064652中);

株系MON87705(大豆,品质性-除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-9241,描述于US-A 2010-0080887或WO 2010/037016中);株系MON87708(大豆,除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA9670,描述于WO 2011/034704中);株系MON87754(大豆,品质性,保藏为ATCC PTA-9385,描述于WO 2010/024976中);株系MON87769(黄豆,品质性,保藏为ATCC PTA-8911,描述于US-A 2011-0067141或WO 2009/102873中);株系MON88017(玉米,昆虫防治-除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-5582,描述于US-A 2008-028482或WO 2005/059103中);株系MON88913(棉花,除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-4854,描述于WO 2004/072235US-A 2006-059590中);株系MON89034(玉米,昆虫防治,保藏为ATCC PTA-7455,描述于WO 2007/140256或US-A 2008-260932中);株系MON89788(大豆,除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-6708,描述于US-A 2006-282915或WO 2006/130436中);株系MS11(油菜,控制授粉-除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-850或PTA-2485,描述于WO 01/031042中);株系MS8(油菜,控制授粉-除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-730,描述于WO 01/041558或US-A 2003-188347中);株系NK603(玉米,除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-2478,描述于US-A 2007-292854中);株系PE-7(稻,昆虫防治,未保藏,描述于WO 2008/114282中);株系RF3(油菜,控制授粉-除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-730,描述于WO 01/041558或US-A 2003-188347中);株系RT73(油菜,除草剂耐受性,未保藏,描述于WO 02/036831或US-A 2008-070260中);株系T227-1(糖用甜菜,除草剂耐受性,未保藏,描述于WO 02/44407或US-A 2009-265817中);株系T25(玉米,除草剂耐受性,未保藏,描述于US-A 2001-029014或WO 01/051654中);株系T304-40(棉花,昆虫防治-除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-8171,描述于US-A 2010-077501或WO 2008/122406中);株系T342-142(棉花,昆虫防治,未保藏,描述于WO 2006/128568中);株系TC1507(玉米,昆虫防治-除草剂耐受性,未保藏,描述于US-A 2005-039226或WO 2004/099447中);株系VIP1034(玉米,昆虫防治-除草剂耐受性,保藏为ATCC PTA-3925,描述于WO 03/052073中);株系32316(玉米,昆虫防治-除草剂耐受性,保藏为PTA-11507,描述于WO 2011/084632中);株系4114(玉米,昆虫防治-除草剂耐受性,保藏为PTA-11506,描述于WO 2011/084621中)。

[0383] 施用率和时间

[0384] 当本发明的活性化合物被用作杀真菌剂时,根据施用种类的不同,施用率可在较宽范围内变化。本发明活性化合物的施用率为:

[0385] ●当处理植物部位时,例如叶子:0.1至10000g/ha,优选10至1000g/ha,更优选50至300g/ha(当以浇灌或滴注的方式施用,甚至可以降低施用率,特别是当使用惰性物质例如岩棉或珍珠岩时);

[0386] ●当处理种子时:每100kg种子2至200g,优选每100kg种子3至150g,更优选每100kg种子2.5至25g,甚至更优选每100kg种子2.5至12.5g;

[0387] ●当处理土壤时:0.1至10000g/ha,优选1至5000g/ha。

[0388] 这些施用率仅仅是为了示例,而非限制本发明的目的。

[0389] 因此,本发明的活性成分或组合物可用于在处理后的一段时期内保护植物免于所述病原体的侵袭。在用活性成分处理植物后,提供保护的时间通常延续1至28天,优选1至14天,更优选1至10天,最优选1至7天,或者在种子处理后最高达200天。

[0390] 本发明的处理方法还提供化合物(A)和(B)和/或(C)同时、分别或相继的使用或施用方法。如果单独的活性成分以相继的方式(即,不同的时间)被施用,则它们在合理的较短

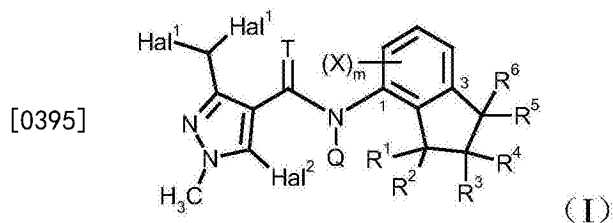
时间内(例如几小时或几天)被逐一施用。优选地,施用化合物(A)和(B)和/或(C)的顺序在本发明中是不重要的。

[0391] 所列植物可根据本发明特别有利地用通式(I)的化合物和本发明的活性组合物进行处理。所述活性成分或组合物的上述优选范围也适用于对这些植物的处理。特别强调的是使用本文中具体提到的化合物或组合物进行植物处理。

[0392] 通过以下实施例阐述本发明。然而,本发明不限于这些实施例。

[0393] 制备实施例

[0394] 类相比于上述实施例,并根据制备本发明的化合物的方法的一般描述,可获得下表1的化合物。



[0396] 表1

[0397]

实施例	Hal ¹	Hal ²	T	Q	X	m	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	logP	
1	F	F	O	H	-	0	Me	H	H	H	-C(Cl ₂)CH ₂ -		3,68[a]	
2	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	H	H	-C(Cl ₂)CH ₂ -			
3	F	F	O	H	-	0	H	H	<i>i</i> Pr	H	H	H		
4	F	Cl	O	H	-	0	H	H	<i>i</i> Pr	H	H	H		

[0398]

5	F	F	O H	-	0	H	H	<i>i</i> Pr	H	Me	Me	4,69[a]	
6	F	Cl	O H	-	0	H	H	<i>i</i> Pr	H	Me	Me	4,95[a]	
7	F	F	O H	-	0	H	H	Me	H	H	H	3,31[a]	
8	F	Cl	O H	-	0	H	H	Me	H	H	H	3,67[a]	
9	F	F	O H	-	0	Me	H	<i>i</i> Pr	H	Me	Me		
10	F	Cl	O H	-	0	Me	H	<i>i</i> Pr	H	Me	Me		
11	F	F	O H	-	0	H	H	H	H	-CH ₂ -CH ₂ -		3,33[a]	
12	F	Cl	O H	4-Cl	1	Me	H	H	H	Me	Me	4,6[a]; 4,53[b]	
13	F	Br	O H	-	0	H	H	Me	H	Me	Me	4,16[a]	
14	F	Cl	O H	-	0	H	H	H	H	-CH ₂ -CH ₂ -		3,58[a]	
15	F	Cl	O H	-	0	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	4,44[a]	
16	F	Cl	O H	4- <i>i</i> Pr	1	Me	H	H	H	Me	Me	4,57[a]; 4,57[b]	
17	F	F	O H	4- <i>i</i> Pr	1	Me	H	H	H	Me	Me	4,35[a]; 4,28[b]	
18	F	Cl	O H	4-Me	1	Me	H	H	H	Me	Me	4,27[a]; 4,2[b]	
19	F	F	O H	4-Me	1	Me	H	H	H	Me	Me	3,99[a]; 3,92[b]	
20	F	Cl	O H	4-I	1	Me	H	H	H	Me	Me	4,91[a]; 4,89[b]	
21	F	Cl	O H	-	0	H	H	<i>i</i> Pr	H	Me	H	4,69[a]	R ₃ 和R ₅ 呈顺式构型
22	F	Cl	O H	-	0	H	H	H	H	=N-O-Bu		4,24[a]	
23	F	Cl	O H	-	0	H	H	H	H	=N-O-Pr		3,76[a]	
24	F	F	O H	-	0	H	H	H	H	=N-O-Bu		3,96[a]	
25	F	Cl	O H	-	0	H	H	H	H	=N-O-Me		2,82[a]	
26	F	Cl	O H	-	0	H	H	H	H	=N-O-Et		3,27[a]	
27	F	F	O H	-	0	H	H	H	H	=N-O-Et		3,06[a]	
28	F	F	O H	-	0	H	H	H	H	=N-O-Pr		3,52[a]	
29	F	F	O H	-	0	H	H	H	H	=N-O-Me		2,59[a]	
30	F	Cl	O H	-	0	H	H	Et	H	H	H	4,01[a]	
31	F	Cl	O H	-	0	Me	H	H	H	H	H	3,44[a]	
32	F	F	O H	-	0	H	H	-(CH ₂) ₄ -		Me	H	4,39[a]	
33	F	Cl	O H	-	0	H	H	-(CH ₂) ₄ -		Me	H	4,63[a]	
34	F	F	O H	-	0	Me	H	H	H	<i>i</i> Pr	H	4,19[a]	R ₁ 和R ₅ 呈顺式构型
35	F	Cl	O H	-	0	Me	H	H	H	<i>i</i> Pr	H	4,46[a]	R ₁ 和R ₅ 呈顺式构型
36	F	Cl	O H	4-Br	1	Me	H	H	H	Me	Me	4,77[a]; 4,68[b]	
37	F	Cl	O H	4-F	1	Me	H	H	H	Me	Me	4,11[a]	
38	F	F	O H	4-Br	1	Me	H	H	H	Me	Me	4,45[a]; 4,35[b]	
39	F	Cl	O H	-	0	H	H	CH ₂ -Ph	H	H	H	4,41[a]	
40	F	Cl	O H	-	0	H	H	H	H	<i>i</i> Bu	H	4,87[a]	
41	F	F	O H	-	0	H	H	H	H	<i>i</i> Bu	H	4,59[a]	
42	F	Br	O H	-	0	Me	H	H	H	Me	Me	4,03[a]	
43	F	Cl	O H	-	0	Me	H	H	H	Me	H	3,89[a]	R ₁ 和R ₅ 呈反式构型
44	F	Cl	O H	-	0	Me	H	H	H	Me	H	3,69[a]	R ₁ 和R ₅ 呈顺式构型

[0399]

45	F	F	O	H	-	0	H	H	Me	H	Me	Me	3,94[a]	
46	F	Cl	O	H	-	0	H	H	Me	H	Me	Me	4,19[a]	
47	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	iPr	H	H	H	4,68[a]	R ₁ 和R ₅ 呈顺式构型
48	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	iPr	H	H	H	4,49[a]	R ₁ 和R ₅ 呈反式构型
49	F	Cl	S	H	-	0	Me	H	H	H	-CH ₂ -CH ₂ -		3,85[a]	
50	F	F	O	H	-	0	Me	H	H	H	-CH ₂ -CH ₂ -		3,55[a]	
51	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	H	H	-CH ₂ -CH ₂ -		3,83[a]	
52	F	Cl	O	H	-	0	H	H	H	H	Me	Et	4,31[a]	
53	F	Cl	O	H	-	0	H	H	H	H	Me	Et	4,04[a]	
54	F	Cl	O	H	-	0	H	H	H	H	-(CH ₂) ₄ -	H	4,54[a]	
55	F	F	S	H	4-Br	1	Me	H	H	H	Me	Me	4,64[a]; 4,49[b]	
56	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	iPr	H	H	H	4,68[a]	
57	F	Cl	O	H	-	0	H	H	cPe	H	H	H	5,03[a]	
58	F	F	O	H	-	0	Me	H	H	H	=N-O-Me		2,75[a]	
59	F	Cl	O	H	-	0	H	H	Me	Me	=N-O-Me		3,55 ; 3,68[a]	
60	F	F	S	H	-	0	Me	H	H	H	-CH ₂ -CH ₂ -		3,71[a]	
61	F	F	O	H	-	0	H	H	Me	Me	=N-O-Me		3,29 ; 3,41[a]	
62	F	Cl	O	H	-	0	H	H	Me	H	Me	H	3,87[a]	R ₃ 和R ₅ 呈顺式构型
63	F	Br	O	H	-	0	H	H	Me	Me	=N-O-Me		3,57 ; 3,7[a]	
64	F	F	O	H	-	0	Me	H	Me	H	Me	Me	3,96[a]	R ₁ 和R ₃ 呈反式构型
65	F	B	O	H	-	0	Me	H	Me	H	Me	Me	4,23[a]	R ₁ 和R ₃ 呈反式构型
66	F	Cl	O	H	-	0	H	H	H	H	iBu	H	4,87[a]	
67	F	Cl	O	H	-	0	H	H	H	H	tBu	H	4,64[a]	
68	F	Br	O	H	-	0	H	H	iPr	H	Me	Me	4,92[a]	
69	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	H	H	-CH ₂ -tBu	H	5,22[a]	
70	F	F	O	H	-	0	Me	H	H	H	-CH ₂ -tBu	H	4,92[a]	
71	F	Br	O	H	-	0	H	H	Me	Me	H	H	3,87[a]	
72	F	F	O	H	-	0	H	H	Me	Me	H	H	3,64[a]	
73	F	Cl	O	H	-	0	H	H	Me	Me	H	H	3,21[a]	
74	F	Cl	S	H	-	0	H	H	H	H	tBu	H	4,64[a]	
75	F	F	S	H	-	0	H	H	H	H	tBu	H	4,51[a]	
76	F	Br	O	H	-	0	Me	H	H	H	-CH ₂ -CH ₂ -		3,83[a]	
77	F	Cl	O	H	-	0	H	H	Me	Me	Me	H	4,19[a]	
78	F	F	O	H	-	0	H	H	Me	Me	Me	H	3,92[a]	
79	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	H	H	iBu	H	4,98[a]	
80	F	F	O	H	-	0	Me	H	H	H	iBu	H	4,71[a]	
81	F	Br	O	H	-	0	H	H	Me	Me	Me	H	4,16[a]	
82	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	H	H	=N-O-Et		3,42[a]	
83	F	F	O	H	-	0	Me	H	H	H	=N-O-Et		3,18[a]	
84	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	H	H	=N-O-Pr		3,92[a]	
85	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	Me	H	Me	Me	4,2[a]	
86	F	F	O	H	-	0	H	H	Et	H	Me	Me	4,34[a]	
87	F	F	S	H	-	0	Me	H	H	H	-CH ₂ -tBu	H	5,08[a]	
88	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	H	H	=N-O-Me		2,98[a]	

[0400]

89	F	Cl	O	H	-	0	Me	Me	H	H	H	H	3,53[a]	
90	F	Cl	O	H	-	0	H	H	Et	H	Me	Me	4,61[a]	
91	F	F	O	H	-	0	Me	H	H	H	=N-O-Pr		3,67[a]	
92	F	Cl	S	H	-	0	H	H	iPr	H	Me	Me	4,9[a]	
93	F	Cl	O	H	-	0	H	H	Et	Et	Me	H	4,92[a]	
94	F	Br	O	H	-	0	H	H	Et	Et	Me	H	4,92[a]	
95	F	F	S	H	-	0	H	H	iPr	H	Me	Me	4,76[a]	
96	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	H	H	Me	H	3,69[a]	R ₁ 和R ₅ 呈顺式构型
97	F	F	O	H	-	0	H	H	H	H	tBu	H	4,39[a]	
98	F	Cl	S	H	-	0	Me	H	H	H	-CH ₂ -tBu	H	5,31[a]	
99	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	H	H	iBu	H	5,01[a]	
100	F	F	O	H	-	0	Me	Me	H	H	H	H	3,31[a]	
101	F	F	O	H	-	0	H	H	Et	Et	Me	H	4,67[a]	
102	F	Br	S	H	-	0	H	H	iPr	H	Me	Me	4,87[a]	
103	F	F	O	H	-	0	Me	H	H	H	-(CH ₂) ₄ -		4,39[a]	
104	F	F	S	H	-	0	Me	H	H	H	-(CH ₂) ₅ -		4,88[a]	
105	F	Cl	S	H	-	0	H	H	Et	H	Me	Me	4,58[a]	
106	F	F	S	H	-	0	H	H	Et	H	Me	Me	4,46[a]	
107	F	F	O	H	-	0	Me	H	H	H	-(CH ₂) ₅ -		4,73[a]	
108	F	Cl	S	H	-	0	Me	H	H	H	-(CH ₂) ₅ -		5,01[a]	
109	F	Cl	O	H	-	0	H	H	H	H	Me	H	3,52[a]	
110	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	H	H	-(CH ₂) ₅ -		5,01[a]	
111	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	H	H	-(CH ₂) ₄ -		4,64[a]	
112	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	H	H	Et	Et	4,82[a]	
113	F	F	O	H	-	0	Me	H	H	H	Et	Et	4,56[a]	
114	F	Br	O	H	-	0	Me	H	H	H	Et	Et	4,82[a]	
115	F	Cl	O	H	-	0	Me	H	H	H	Me	Et	4,46[a]	
116	F	F	O	H	-	0	Me	H	H	H	Me	Et	4,16[a]	
117	F	Br	O	H	-	0	Me	H	H	H	Me	Et	4,44[a]	

[0401] Me=甲基,Et=乙基,Pr=丙基,iPr=异丙基,cPr=环丙基,Bu=丁基,iBu=异丁基,tBu=叔丁基,Ph=苯基,cPe=环戊基

[0402] 类比于上述实施例,并根据制备本发明的化合物的方法的一般描述,可获得下表2的式(III-a)的化合物。

[0403] 表2

[0404]

实施例	Q	X	m	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	logP	GCMS (min)	
III-a-1	H	-	0	Me	H	H	H	-C(Cl ₂)CH ₂ -		2,94 ; 3,04[a]		
III-a-2	H	-	0	H	H	iPr	H	H	H	2,25[a]		
III-a-3	H	-	0	H	H	iPr	H	Me	Me	2,8[a]		
III-a-4	H	-	0	H	H	H	H	-CH ₂ -CH ₂ -		1,37[a]		
III-a-5	H	4-Cl	1	Me	H	H	H	Me	Me	3,68[a]		
III-a-6	H	-	0	H	H	Me	H	Me	Me	1,95[a]		
III-a-7	H	-	0	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H	2,1[a]		

[0405]

III-a-8	H	4-cPr	1	Me	H	H	H	Me	Me	2,81[a]		
III-a-9	H	4-Me	1	Me	H	H	H	Me	Me	2,16[a]; 3,52[b]		
III-a-10	H	4-I	1	Me	H	H	H	Me	Me	4,1[a]		
III-a-11	H	-	0	H	H	iPr	H	Me	H	2,34[a]		R ₃ 和R ₅ 呈 顺式构型
III-a-12	H	-	0	H	H	H	H	=N-O-Pr		2,26[a]		盐酸盐
III-a-13	H	-	0	H	H	H	H	=N-O-Bu		2,86[a]		盐酸盐
III-a-14	H	-	0	H	H	H	H	=N-O-Me		1,26[a]		盐酸盐
III-a-15	H	-	0	H	H	H	H	=N-O-Et		1,75[a]		盐酸盐
III-a-16	H	-	0	H	H	Et	H	H	H	1,76[a]		
III-a-17	H	-	0	H	H	-(CH ₂) ₄ -		Me	H	2,39[a]		
III-a-18	H	-	0	Me	H	H	H	iPr	H	2,73[a]		R ₁ 和R ₅ 呈 顺式构型
III-a-19	H	-	0	Me	H	H	H	iPr	H	2,86[a]		R ₃ 和R ₅ 呈 反式构型
III-a-20	H	4-Br	1	Me	H	H	H	Me	Me	3,85[a]; 3,95[b]		
III-a-21	H	-	0	H	H	CH ₂ -Ph	H	H	H	2,54[a]		
III-a-22	H	-	0	H	H	H	H	iBu	H	2,64[a]		
III-a-23	H	-	0	Me	H	H	H	Me	H	1,76[a]		R ₁ 和R ₅ 呈 顺式构型
III-a-24	H	-	0	Me	H	iPr	H	H	H	2,9[a]		
III-a-25	H	-	0	Me	H	H	H	-CH ₂ -CH ₂ -		1,93[a]		
III-a-26	H	-	0	H	H	H	H	Et	Me	1,88[a]		
III-a-27	H	-	0	H	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H			
III-a-28	H	-	0	H	H	cPe	H	H	H	2,94[a]		
III-a-29	H	-	0	Me	H	H	H	=N-O-Pr		2,78[a]		盐酸盐
III-a-30	H	-	0	Me	H	H	H	=N-O-Et		2,26[a]		盐酸盐
III-a-31	H	-	0	Me	H	H	H	=N-O-Me		1,76[a]		盐酸盐
III-a-32	H	-	0	H	H	Me	Me	=N-O-Me		2,08[a]		盐酸盐
III-a-33	H	-	0	H	H	Me	H	Me	H	1,44[a]	4.6	R ₃ 和R ₅ 呈 顺式构型
III-a-34	H	-	0	Me	H	Me	H	Me	Me	2,28[a]		R ₁ 和R ₂ 呈 反式构型
III-a-35	H	-	0	H	H	H	H	tBu	H	2,4[a]		
III-a-36	H	-	0	Me	H	H	H	CH ₂ -tBu	H	3,83[a]		R ₁ 和R ₅ 呈 顺式构型

[0406]

III-a-37	H	-	0	H	H	Me	Me	H	H		4.20	
III-a-38	H	-	0	H	H	Me	Me	Me	H		4.49	
III-a-39	H	-	0	Me	H	H	H	iBu	H	3,42[a]		R ₁ 和R ₅ 呈顺式构型
III-a-40	H	-	0	H	H	Et	H	Me	Me	2,47[a]		
III-a-41	H	-	0	Me	Me	H	H	H	H			
III-a-42	H	-	0	H	H	Et	Et	Me	H	2,63[a]	5.48	
III-a-43	H	-	0	Me	H	H	H	-(CH ₂) ₄ -		2,86[a]	5.86	
III-a-44	H	-	0	Me	H	H	H	-(CH ₂) ₅ -		3,35[a]	6.31	
III-a-45	H	-	0	Me	H	H	H	Et	Et		5.19	
III-a-46	H	-	0	Me	H	H	H	Me	Et		4.89	

[0407] 类比于上述实施例,并根据制备本发明的化合物的方法的一般描述,可获得下表3的式(III-b)的化合物。

[0408] 表3

[0409]

实施例	X	m	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	logP	GCMS (min)	
III-b-1	-	0	Me	H	H	H	-C(Cl ₂)CH ₂ -			5.96	
III-b-2	-	0	H	H	iPr	H	H	H		4.57	
III-b-3	-	0	H	H	iPr	H	Me	Me	6,7[a]	5.02	
III-b-4	-	0	H	H	H	H	-CH ₂ -CH ₂ -		4,86[a]	4.60	
III-b-5	-	0	H	H	-(CH ₂) ₄ -		H	H		5.52	
III-b-6	-	0	H	H	iPr	H	Me	H		4.82	
III-b-7	-	0	H	H	H	H	=N-O-Pr		5,14[a]		
III-b-8	-	0	H	H	H	H	=N-O-Bu		5,71[a]		
III-b-9	-	0	H	H	H	H	=N-O-Me			5.25	
III-b-10	-	0	H	H	H	H	=N-O-Et		4,49[a]		
III-b-11	-	0	H	H	Et	H	H	H		4.32	
III-b-12	-	0	H	H	-(CH ₂) ₄ -		Me	H		5.47	
III-b-13	-	0	Me	H	H	H	iPr	H	5,31[a]	4.80	R ₁ 和R ₅ 呈顺式构型
III-b-14	-	0	Me	H	H	H	iPr	H		4.77	R ₁ 和R ₅ 呈反式构型
III-b-15	-	0	H	H	CH ₂ -Ph	H	H	H		6.93	
III-b-16	-	0	H	H	H	H	iBu	H	6,57[a]		
III-b-17	-	0	Me	H	H	H	Me	H		4.12	R ₁ 和R ₅ 呈顺式构型
III-b-18	-	0	Me	H	H	H	Me	H		4.00	R ₁ 和R ₅ 呈反式构型
III-b-19	-	0	Me	H	iPr	H	H	H		4.43	

[0410]

III-b-20	-	0	Me	H	H	H	-CH ₂ -CH ₂ -		5,28[a]		
III-b-21	-	0	H	H	cPe	H	H	H		5.95	
III-b-22	-	0	H	H	H	H	=N-O-Pr		5,56[a]		
III-b-23	-	0	H	H	H	H	=N-OEt		4,9[a]		
III-b-24	-	0	H	H	H	H	=N-O-Me		4,23[a]		
III-b-25	-	0	H	H	Me	Me	=N-O-Me		4,98[a]; 5,17[a]		
III-b-26	-	0	Me	H	H	H	Me	H		4.18	R ₁ 和R ₅ 呈 顺式构型
III-b-27	-	0	H	H	Me	Me	H	H		3.82	
III-b-28	-	0	H	H	Me	Me	Me	H		4.13	
III-b-29	-	0	H	H	Et	H	Me	Me	6,28[a]		

[0411] 根据EEC Directive 79/831 Annex V.A8通过HPLC(高效液相色谱)在反相柱上用以下方法测量logP值:

[0412] ^[a]LC-MS的测定使用0.1%甲酸水溶液和乙腈(含有0.1%甲酸)作为洗脱液在pH 2.7下进行;线性梯度为从10%乙腈至95%乙腈。

[0413] ^[b]LC-MS的测定使用0.001摩尔的碳酸氢铵水溶液作为洗脱液在pH7.8下进行;线性梯度为从10%乙腈至95%乙腈。

[0414] 使用具有已知的logP值的无支链的烷-2-酮(具有3至16个碳原子)进行标定(logP值使用在两个连续的烷酮之间线性内插法通过保留时间测定)。其λ最大值使用200nm至400nm UV光谱在色谱信号的最大值处测定。

[0415] NMR峰列表

[0416] 所选实施例的¹H-NMR数据是以¹H-NMR-峰列表的形式给出的。对每一个信号峰都以ppm为单位列出了它的δ值,圆括号中为其信号强度。在每对δ值-信号强度之间以分号作为分隔符。

[0417] 因此实施例的峰列表的形式为:

[0418] δ₁(强度₁);δ₂(强度₂);……;δ_i(强度_i);……;δ_n(强度_n);

[0419] 活性成分的NMR峰列表

[0420]

实施例 1, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz
9.5737 (4.33); 7.5348 (2.91); 7.5152 (3.35); 7.3085 (2.19); 7.2532 (1.96);
7.2337 (3.82); 7.2141 (2.00); 7.1744 (5.05); 7.0404 (2.45); 6.9503 (3.80);
6.9319 (3.37); 5.7699 (1.36); 3.8474 (16.00); 3.3571 (3.03); 3.0604 (0.41);

[0421]

3.0387 (0.92); 3.0181 (1.26); 2.9972 (1.82); 2.9756 (0.93); 2.9353 (1.01); 2.9304 (1.16); 2.9131 (1.32); 2.9072 (1.23); 2.8946 (0.61); 2.8889 (0.62); 2.8718 (0.65); 2.8663 (0.57); 2.5726 (0.78); 2.5667 (0.99); 2.5595 (0.47); 2.5519 (0.97); 2.5456 (0.95); 2.5382 (1.35); 2.5322 (1.73); 2.5277 (0.93); 2.5184 (8.16); 2.5142 (15.72); 2.5097 (20.80); 2.5053 (14.58); 2.5009 (6.75); 2.4094 (0.98); 2.3865 (2.22); 2.3748 (0.90); 2.3635 (1.04); 2.3520 (1.55); 2.3292 (0.62); 2.2506 (4.49); 2.2306 (4.84); 1.9528 (4.75); 1.9326 (4.08)

实施例 5, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

9.3585 (0.75); 7.4290 (0.57); 7.4030 (0.69); 7.3241 (0.52); 7.1842 (0.42); 7.1585 (0.84); 7.1451 (1.21); 7.1327 (0.45); 7.0079 (0.77); 6.9829 (0.61); 6.9663 (0.57); 3.8272 (3.28); 3.3253 (16.00); 2.8863 (0.32); 2.5134 (0.96); 2.5073 (1.94); 2.5013 (2.66); 2.4951 (1.98); 2.4890 (1.16); 1.7184 (0.35); 1.3709 (4.55); 1.3555 (0.81); 1.0600 (2.13); 1.0384 (5.35); 0.9286 (2.10); 0.9075 (2.10); 0.8940 (0.34); -0.0002 (1.47)

实施例 6, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

9.5548 (1.64); 7.4542 (0.79); 7.4279 (0.95); 7.3195 (1.01); 7.1878 (0.87); 7.1623 (1.72); 7.1402 (2.59); 7.0090 (1.64); 6.9858 (1.30); 6.9613 (1.10); 3.9187 (9.56); 3.3225 (16.00); 2.9866 (0.51); 2.9615 (0.63); 2.9323 (0.70); 2.9080 (0.66); 2.5319 (0.57); 2.5130 (1.93); 2.5070 (4.27); 2.5009 (6.28); 2.4949 (4.66); 2.4889 (2.21); 2.4784 (0.71); 2.4448 (0.58); 1.9887 (0.60); 1.8108 (0.33); 1.8022 (0.41); 1.7811 (0.57); 1.7598 (0.50); 1.7494 (0.60); 1.7243 (0.66); 1.7171 (0.76); 1.6925 (0.59); 1.3705 (9.62); 1.3553 (2.58); 1.2956 (0.42); 1.1973 (0.63); 1.1743 (0.39); 1.0583 (4.51); 1.0390 (10.80); 0.9950 (0.50); 0.9858 (0.34); 0.9220 (4.49); 0.9009 (4.56); 0.8754 (0.40); -0.0002 (3.23)

实施例 7, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 400,13 MHz

7.9368 (2.52); 7.9166 (2.56); 7.5874 (1.30); 7.2608 (15.71); 7.1928 (1.73); 7.1735 (3.40); 7.1540 (2.04); 7.1293 (2.41); 7.0208 (3.10); 7.0022 (2.66); 6.9948 (5.15); 6.8602 (2.46); 3.8526 (16.00); 3.1334 (0.63); 3.1256 (0.38); 3.1165 (1.60); 3.0971 (1.72); 3.0808 (0.80); 3.0705 (0.44); 3.0314 (1.13); 3.0122 (1.25); 2.9935 (1.41); 2.9742 (1.60); 2.6758 (0.35); 2.6582 (0.93);

[0422]

2.6406 (1.48); 2.6226 (2.32); 2.6124 (2.44); 2.5985 (0.75); 2.5827 (1.78); 2.5648 (0.96); 2.4804 (1.40); 2.4629 (1.06); 2.4424 (1.26); 2.4250 (1.03); 1.5824 (10.81); 1.2933 (0.34); 1.2760 (0.36); 1.2559 (0.34); 1.1972 (0.34); 1.1827 (13.50); 1.1663 (12.68); 1.1534 (0.50); -0.0002 (9.95); -0.0085 (0.32)

实施例 8, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 400,13 MHz

7.9753 (1.53); 7.9551 (1.56); 7.8580 (0.97); 7.2597 (4.71); 7.2254 (1.70); 7.1986 (1.13); 7.1793 (2.22); 7.1598 (1.32); 7.0905 (3.54); 7.0253 (2.05); 7.0068 (1.64); 6.9557 (1.76); 3.9488 (16.00); 3.1368 (0.42); 3.1198 (1.06); 3.1004 (1.14); 3.0841 (0.54); 3.0522 (0.78); 3.0330 (0.84); 3.0144 (0.92); 2.9951 (1.04); 2.6621 (0.63); 2.6444 (0.98); 2.6264 (1.50); 2.6160 (1.62); 2.6022 (0.50); 2.5860 (1.16); 2.5682 (0.62); 2.4979 (0.95); 2.4804 (0.69); 2.4601 (0.85); 2.4427 (0.67); 1.6011 (2.98); 1.1844 (8.79); 1.1679 (8.23); -0.0002 (3.13)

实施例 11, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

9.3723 (3.82); 7.4070 (2.95); 7.3809 (3.59); 7.3353 (2.28); 7.1565 (4.86); 7.1382 (2.19); 7.1125 (3.76); 7.0866 (1.99); 6.9777 (2.37); 6.9286 (0.54); 6.5800 (3.61); 6.5553 (3.41); 5.7582 (0.44); 3.8299 (16.00); 3.3274 (35.81); 2.9396 (2.71); 2.9147 (5.03); 2.8895 (3.60); 2.7305 (0.44); 2.5070 (7.15); 2.5012 (9.41); 2.4954 (7.12); 2.1071 (3.28); 2.0814 (5.21); 2.0563 (2.95); 1.2549 (1.09); 1.2323 (1.28); 1.2091 (0.36); 1.1713 (0.76); 1.1490 (0.70); 0.9601 (1.70); 0.9349 (6.66); 0.9252 (5.21); 0.9027 (1.17); 0.8875 (5.78); 0.8782 (7.44); 0.8529 (1.88); -0.0002 (1.34)

实施例 12, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 399,95 MHz

9.6470 (2.98); 8.3157 (1.01); 7.3733 (2.41); 7.3523 (3.23); 7.2686 (1.64); 7.2253 (3.68); 7.2040 (2.86); 7.1935 (0.35); 7.1341 (3.52); 6.9999 (1.77); 3.9205 (15.79); 3.4628 (0.57); 3.4502 (0.66); 3.4405 (0.79); 3.4332 (0.80); 3.4229 (0.78); 3.4120 (0.59); 3.4053 (0.40); 3.3211 (58.88); 2.6751 (1.47); 2.6705 (1.91); 2.6660 (1.39); 2.5659 (0.45); 2.5103 (118.46); 2.5059 (222.93); 2.5014 (282.11); 2.4969 (200.46); 2.4925 (94.71); 2.3328 (1.31); 2.3281 (1.77); 2.3237 (1.28); 2.2178 (1.24); 2.1953 (1.39); 2.1852 (1.55); 2.1631 (1.39); 1.6593 (1.56); 1.6484 (1.56); 1.6267 (1.41); 1.6159 (1.36);

[0423]

1.4664 (16.00); 1.3979 (1.09); 1.3741 (15.79); 1.3100 (1.67); 1.1915 (9.40); 1.1825 (2.64); 1.1740 (9.26); 0.1459 (0.56); 0.0079 (6.13); -0.0002 (134.00); -0.0085 (4.50); -0.1497 (0.60)

实施例 13, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 399,95 MHz

9.5810 (2.77); 7.4570 (1.08); 7.4377 (1.21); 7.2749 (1.40); 7.1928 (1.34); 7.1737 (2.65); 7.1543 (1.53); 7.1402 (3.07); 7.0295 (3.06); 7.0108 (2.65); 3.9491 (15.37); 3.3337 (34.15); 2.9814 (1.07); 2.9626 (1.25); 2.9414 (1.37); 2.9227 (1.31); 2.8987 (0.35); 2.5319 (0.62); 2.5185 (12.81); 2.5142 (24.88); 2.5097 (31.94); 2.5052 (22.63); 2.5010 (10.70); 2.4817 (1.29); 2.4562 (1.35); 2.4417 (1.04); 2.4163 (1.17); 2.0815 (0.65); 2.0637 (1.04); 2.0564 (0.77); 2.0458 (0.83); 2.0387 (0.95); 2.0205 (0.59); 1.2537 (16.00); 1.0446 (8.62); 1.0273 (8.31); 0.9340 (13.98)

实施例 14, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz

7.9773 (2.13); 7.9508 (2.30); 7.8781 (1.21); 7.2607 (26.17); 7.2075 (1.41); 7.1816 (2.53); 7.1554 (1.39); 7.0863 (3.48); 6.9066 (1.81); 6.5077 (2.62); 6.4824 (2.45); 5.3001 (1.10); 3.9574 (16.00); 3.8421 (0.57); 3.0197 (2.25); 2.9951 (3.61); 2.9692 (2.59); 2.2250 (2.99); 2.1991 (3.95); 2.1745 (2.67); 1.5559 (11.14); 1.2959 (0.56); 1.2877 (0.44); 1.2725 (0.60); 1.2600 (0.57); 1.2353 (0.34); 0.9755 (0.51); 0.9447 (6.98); 0.9302 (5.27); 0.9253 (7.43); 0.8943 (0.68); 0.8822 (0.94); 0.8582 (0.43); -0.0002 (7.09)

实施例 15, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 499,93 MHz

7.9595 (0.86); 7.9423 (1.18); 7.9392 (1.17); 7.9220 (1.00); 7.8728 (0.69); 7.8221 (0.80); 7.2544 (1.43); 7.2174 (0.68); 7.2020 (1.37); 7.1973 (0.93); 7.1863 (0.85); 7.1810 (1.09); 7.1745 (0.85); 7.1590 (1.56); 7.1434 (0.91); 7.0892 (1.69); 7.0730 (2.12); 7.0039 (1.31); 6.9903 (2.24); 6.9810 (1.16); 6.9770 (1.27); 6.9650 (1.06); 5.2780 (3.73); 3.9239 (16.00); 3.1302 (0.67); 3.1185 (0.67); 2.8753 (5.50); 2.8066 (0.57); 2.7901 (0.75); 2.7795 (6.01); 2.5487 (0.57); 2.5395 (0.94); 2.5159 (0.99); 2.5115 (1.06); 2.4978 (0.40); 1.8163 (0.50); 1.8066 (0.65); 1.7957 (0.57); 1.7878 (0.55); 1.7797 (0.41); 1.7772 (0.41); 1.7281 (1.09); 1.7228 (1.89); 1.7162 (3.78); 1.7085 (2.40); 1.7015 (2.34); 1.6883 (0.40); 1.6601 (0.37); 1.6571 (0.35); 1.6451 (1.32); 1.6438 (1.31); 1.6335 (2.66); 1.6241 (2.33); 1.6156 (1.05); 1.6114 (0.92);

[0424]

1.6093 (0.90); 1.5995 (0.61); 1.5934 (0.47); 1.5859 (0.39); 1.4567 (0.44);
1.4173 (0.35); 1.4046 (0.40); 1.3922 (0.35); 1.3659 (0.35); 1.3479 (0.41);
1.3434 (0.42); 1.3328 (0.45); 1.3288 (0.46); 1.3250 (0.53); 1.3161 (0.49);
1.3069 (0.42); 1.2988 (0.47); 1.2909 (0.46); 1.2809 (0.43); 1.2722 (0.34);
1.2636 (0.37); -0.0002 (0.88)

实施例 16, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 399,95 MHz

9.4504 (2.95); 7.2635 (1.24); 7.1870 (1.85); 7.1664 (2.02); 7.1289 (2.61);
6.9944 (1.31); 6.7626 (2.60); 6.7420 (2.40); 3.9135 (13.27); 3.3737 (0.57);
3.3551 (0.89); 3.3403 (0.96); 3.3227 (5.61); 2.5045 (16.94); 2.5006 (20.72);
2.1660 (1.18); 2.1441 (1.62); 2.1339 (1.82); 2.1223 (1.02); 2.1116 (2.16);
2.0962 (0.86); 2.0887 (0.74); 2.0750 (0.35); 1.6135 (1.39); 1.6015 (1.40);
1.5816 (1.31); 1.5697 (1.29); 1.5124 (14.09); 1.3960 (16.00); 1.3099 (0.95);
1.1852 (8.38); 1.1679 (7.72); 0.9350 (2.63); 0.9307 (2.83); 0.9140 (2.54);
0.9096 (2.86); 0.7283 (0.46); 0.7028 (1.47); 0.6895 (1.41); 0.6747 (1.42);
0.6617 (1.41); 0.6500 (0.52); 0.6454 (0.52); 0.6368 (0.38); -0.0002 (2.62)

实施例 17, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 399,95 MHz

9.2999 (2.73); 7.2682 (1.49); 7.1991 (2.01); 7.1787 (2.21); 7.1428 (0.33);
7.1338 (3.21); 6.9995 (1.61); 6.7589 (2.86); 6.7382 (2.64); 3.8215 (11.26);
3.3506 (0.66); 3.3221 (33.38); 3.2989 (0.60); 2.6703 (0.41); 2.5055 (46.05);
2.5011 (58.61); 2.4966 (42.59); 2.3279 (0.37); 2.1644 (1.26); 2.1427 (1.53);
2.1326 (1.73); 2.1250 (0.84); 2.1112 (1.92); 2.1040 (1.46); 2.0967 (0.61);
2.0904 (0.80); 2.0831 (0.70); 2.0698 (0.34); 1.6044 (1.48); 1.5912 (1.46);
1.5725 (1.38); 1.5595 (1.37); 1.5098 (16.00); 1.3975 (10.01); 1.3849
(15.52); 1.3070 (0.90); 1.2981 (0.47); 1.2583 (0.53); 1.1668 (8.71); 1.1494
(8.36); 0.9278 (3.23); 0.9100 (3.04); 0.9069 (3.10); 0.8908 (0.37); 0.7204
(0.34); 0.6972 (1.55); 0.6833 (2.37); 0.6793 (2.25); 0.6652 (1.38); 0.0078
(0.86); -0.0002 (20.18); -0.0084 (0.77)

实施例 18, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 399,95 MHz

9.4664 (2.05); 8.3165 (1.20); 7.2676 (1.18); 7.1788 (1.36); 7.1597 (1.65);
7.1330 (2.58); 6.9984 (1.34); 6.9531 (2.16); 6.9330 (1.76); 3.9152 (12.16);
3.3711 (0.70); 3.3533 (1.02); 3.3223 (172.31); 3.2985 (0.81); 2.6748 (1.93);
2.6702 (2.55); 2.6656 (1.89); 2.5235 (8.52); 2.5102 (149.21); 2.5057

[0425]

(293.00); 2.5012 (379.51); 2.4966 (270.49); 2.4921 (127.71); 2.3374 (13.24); 2.3280 (2.82); 2.3235 (1.86); 2.3185 (0.87); 2.1433 (1.10); 2.1219 (1.22); 2.1117 (1.41); 2.0899 (1.21); 1.5849 (1.35); 1.5725 (1.33); 1.5528 (1.27); 1.5406 (1.18); 1.3977 (16.00); 1.2824 (13.64); 1.1801 (7.85); 1.1627 (7.65); 0.1460 (1.08); 0.0080 (9.93); -0.0002 (256.56); -0.0085 (8.41); -0.0220 (0.34); -0.1496 (1.04)

实施例 19, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 399.95 MHz

9.3177 (2.17); 7.2729 (1.43); 7.1940 (1.68); 7.1743 (1.99); 7.1385 (3.22); 7.0042 (1.60); 6.9463 (2.41); 6.9260 (2.06); 3.8228 (9.90); 3.3487 (0.59); 3.3225 (65.48); 3.2973 (0.65); 2.6748 (0.59); 2.6702 (0.78); 2.6660 (0.57); 2.5236 (2.09); 2.5102 (45.46); 2.5057 (91.49); 2.5012 (120.08); 2.4966 (86.48); 2.4922 (41.42); 2.3341 (14.24); 2.1420 (1.26); 2.1205 (1.37); 2.1102 (1.57); 2.0888 (1.34); 1.5752 (1.44); 1.5617 (1.44); 1.5433 (1.34); 1.5299 (1.31); 1.3943 (16.00); 1.3354 (0.45); 1.2724 (14.93); 1.2493 (0.65); 1.1627 (8.47); 1.1454 (8.32); 0.1459 (0.33); 0.0080 (2.66); -0.0002 (78.45); -0.0085 (2.56); -0.1496 (0.34)

实施例 20, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 399.95 MHz

9.5904 (2.92); 7.6849 (3.13); 7.6641 (3.42); 7.2677 (1.64); 7.1518 (3.38); 7.1330 (4.82); 6.9990 (1.85); 3.9183 (14.79); 3.3987 (0.51); 3.3883 (0.63); 3.3816 (0.64); 3.3771 (0.68); 3.3711 (0.67); 3.3664 (0.65); 3.3596 (0.62); 3.3491 (0.55); 3.3215 (32.55); 2.6748 (0.43); 2.6703 (0.58); 2.6657 (0.43); 2.5237 (1.72); 2.5189 (2.61); 2.5103 (32.54); 2.5058 (65.96); 2.5012 (87.15); 2.4966 (62.51); 2.4921 (29.49); 2.3325 (0.40); 2.3280 (0.55); 2.3235 (0.40); 2.2062 (1.18); 2.1838 (1.34); 2.1737 (1.57); 2.1513 (1.35); 1.6746 (1.52); 1.6642 (1.51); 1.6421 (1.39); 1.6318 (1.37); 1.4703 (0.40); 1.4496 (16.00); 1.3976 (1.97); 1.3796 (0.39); 1.3584 (15.90); 1.3098 (1.19); 1.1837 (9.84); 1.1663 (8.95); 0.0080 (0.59); -0.0002 (19.60); -0.0085 (0.59)

实施例 21, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300.16 MHz

8.0251 (1.47); 7.9983 (1.58); 7.8575 (1.11); 7.2823 (1.86); 7.2610 (8.99); 7.2145 (1.06); 7.1888 (2.27); 7.1627 (1.49); 7.1025 (3.81); 7.0849 (2.57); 7.0600 (1.69); 6.9227 (1.87); 3.9530 (16.00); 2.9984 (0.99); 2.9857 (1.06); 2.9726 (1.21); 2.9601 (1.23); 2.8854 (0.82); 2.8594 (1.14); 2.8377 (0.98);

[0426]

2.8118 (1.58); 2.7641 (0.42); 2.7388 (0.64); 2.7344 (0.62); 2.7088 (0.92); 2.6841 (0.81); 2.6591 (0.42); 2.5624 (1.33); 2.5314 (0.93); 2.5146 (1.02); 2.4839 (0.73); 2.1363 (0.60); 2.1234 (0.62); 2.1135 (0.86); 2.1005 (0.91); 2.0908 (0.73); 2.0779 (0.66); 2.0683 (0.36); 1.3154 (0.34); 1.2113 (8.68); 1.1881 (8.62); 1.1244 (0.40); 1.1015 (0.41); 1.0787 (9.04); 1.0556 (8.70); 0.9823 (0.43); 0.9593 (0.45); 0.8395 (0.40); 0.8167 (0.38); 0.6735 (9.37); 0.6511 (9.17); -0.0002 (4.05)

实施例 22, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.1893 (1.58); 8.1635 (1.70); 7.9075 (0.99); 7.5368 (1.55); 7.5346 (1.59); 7.5112 (2.05); 7.3407 (1.36); 7.3144 (2.27); 7.2883 (1.04); 7.2616 (20.93); 7.2465 (0.38); 7.2166 (1.56); 7.0672 (0.35); 7.0369 (3.23); 6.8572 (1.55); 5.3007 (0.34); 4.2078 (2.73); 4.1857 (5.75); 4.1635 (2.85); 3.9590 (12.31); 3.9469 (1.85); 3.9234 (0.34); 2.9602 (16.00); 1.7542 (0.59); 1.7309 (1.63); 1.7225 (0.71); 1.7083 (2.12); 1.7005 (1.35); 1.6821 (1.89); 1.6599 (0.95); 1.4955 (0.45); 1.4708 (1.29); 1.4453 (1.88); 1.4200 (1.95); 1.3960 (1.24); 1.3718 (0.42); 0.9850 (4.59); 0.9605 (9.41); 0.9360 (3.77); 0.0106 (0.33); -0.0002 (11.97); -0.0111 (0.54)

实施例 23, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.1845 (1.46); 8.1581 (1.57); 7.9058 (0.91); 7.5416 (1.44); 7.5170 (1.84); 7.3360 (1.17); 7.3098 (1.97); 7.2836 (0.93); 7.2616 (10.67); 7.2223 (1.29); 7.0426 (2.57); 6.8629 (1.26); 4.4794 (0.40); 4.4586 (1.04); 4.4379 (1.45); 4.4171 (1.10); 4.3963 (0.44); 3.9587 (10.69); 3.9457 (0.82); 2.9499 (13.36); 1.3138 (16.00); 1.2930 (15.91); -0.0002 (6.74); -0.0103 (0.33)

实施例 24, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 400,13 MHz

8.1488 (1.77); 8.1293 (1.87); 7.6709 (0.89); 7.5239 (1.75); 7.5223 (1.81); 7.5048 (2.17); 7.5033 (2.07); 7.3253 (1.42); 7.3057 (2.47); 7.2861 (1.15); 7.2623 (13.69); 7.0674 (1.22); 6.9329 (2.50); 6.7984 (1.23); 4.1996 (3.03); 4.1829 (6.36); 4.1663 (3.11); 3.8564 (8.74); 2.9483 (16.00); 1.7402 (0.61); 1.7233 (1.72); 1.7166 (0.59); 1.7055 (2.11); 1.7002 (1.26); 1.6859 (1.88); 1.6692 (0.79); 1.5789 (9.47); 1.4798 (0.39); 1.4612 (1.36); 1.4466 (0.85); 1.4422 (2.10); 1.4282 (0.90); 1.4233 (2.17); 1.4099 (0.41); 1.4049 (1.35); 1.3866 (0.39); 0.9787 (5.30); 0.9603 (10.95); 0.9418 (4.60); -0.0002 (9.11)

[0427]

实施例 25, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 400,13 MHz

8.1979 (1.02); 8.1780 (1.05); 7.9141 (0.63); 7.5345 (1.18); 7.5153 (1.43);
7.3440 (0.92); 7.3242 (1.57); 7.3047 (0.75); 7.2621 (31.97); 7.2128 (1.05);
7.1690 (1.05); 7.0786 (2.36); 7.0341 (2.27); 6.9444 (1.15); 6.8994 (1.10);
5.3017 (0.47); 3.9986 (16.00); 3.9609 (9.71); 3.9525 (10.51); 3.9353 (0.82);
2.9858 (0.40); 2.9790 (0.44); 2.9618 (5.86); 2.9563 (1.93); 2.9458 (0.43);
2.9390 (0.32); 0.0080 (0.76); -0.0002 (21.20); -0.0085 (0.65)

实施例 26, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.1860 (1.37); 8.1596 (1.47); 7.9112 (0.88); 7.5387 (1.47); 7.5365 (1.50);
7.5131 (1.92); 7.3386 (1.28); 7.3123 (2.14); 7.2862 (1.00); 7.2632 (6.44);
7.2570 (0.82); 7.2188 (1.44); 7.0779 (1.28); 7.0391 (2.99); 6.8990 (0.63);
6.8594 (1.45); 4.2736 (1.40); 4.2501 (4.53); 4.2266 (4.65); 4.2032 (1.53);
3.9562 (11.84); 3.9483 (6.32); 3.9267 (0.33); 2.9599 (16.00); 1.3564 (4.75);
1.3329 (10.15); 1.3094 (4.74); -0.0002 (3.72)

实施例 27, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.1568 (1.61); 8.1304 (1.73); 7.6733 (0.80); 7.5330 (1.52); 7.5305 (1.54);
7.5075 (2.02); 7.3350 (1.36); 7.3088 (2.25); 7.2824 (1.11); 7.2735 (0.32);
7.2615 (31.61); 7.2538 (0.59); 7.2523 (0.49); 7.2509 (0.41); 7.2494 (0.32);
7.1126 (1.13); 6.9334 (2.26); 6.7540 (1.10); 5.3008 (2.17); 4.2699 (1.56);
4.2465 (5.08); 4.2230 (5.17); 4.1995 (1.65); 3.8581 (7.95); 2.9529 (16.00);
1.5660 (1.53); 1.3552 (5.36); 1.3318 (11.58); 1.3082 (5.28); 0.0106 (0.66);
-0.0002 (19.44); -0.0079 (0.43); -0.0111 (0.70)

实施例 28, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.1484 (1.25); 8.1221 (1.35); 7.6688 (0.67); 7.5371 (1.21); 7.5348 (1.22);
7.5116 (1.56); 7.3292 (1.14); 7.3031 (1.84); 7.2767 (1.21); 7.2615 (25.62);
7.1186 (0.86); 6.9392 (1.75); 6.7600 (0.86); 5.3010 (0.77); 4.4772 (0.39);
4.4563 (1.01); 4.4355 (1.36); 4.4148 (1.04); 4.3940 (0.41); 3.8586 (6.18);
2.9409 (13.14); 1.5576 (20.85); 1.3123 (16.00); 1.2915 (15.75); 0.0106
(0.57); -0.0002 (13.25); -0.0111 (0.52)

实施例 29, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.1635 (1.19); 8.1371 (1.29); 7.6802 (0.59); 7.5281 (1.13); 7.5048 (1.49);
7.3411 (1.02); 7.3148 (1.70); 7.2886 (0.80); 7.2615 (25.03); 7.2493 (0.36);

[0428]

7.1059 (0.83); 6.9724 (0.54); 6.9267 (1.70); 6.7471 (0.83); 5.3009 (1.99); 3.9955 (16.00); 3.8578 (5.98); 3.8464 (1.69); 2.9505 (13.01); 0.0106 (0.52); -0.0002 (15.45); -0.0111 (0.58)

实施例 30, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.9656 (1.74); 7.9386 (1.96); 7.8583 (1.13); 7.2590 (5.36); 7.2001 (1.21); 7.1907 (0.56); 7.1745 (2.41); 7.1646 (0.48); 7.1483 (1.56); 7.1421 (0.72); 7.0821 (3.63); 7.0493 (0.35); 7.0252 (2.39); 7.0010 (1.64); 6.9024 (1.80); 3.9569 (2.89); 3.9462 (16.00); 3.1378 (0.95); 3.1117 (1.00); 3.0853 (1.08); 3.0592 (1.16); 3.0430 (0.90); 3.0182 (1.17); 2.9940 (1.34); 2.9692 (1.08); 2.6760 (0.84); 2.6495 (1.05); 2.6235 (0.60); 2.5969 (0.80); 2.5482 (0.83); 2.5227 (1.28); 2.4971 (0.40); 2.4903 (0.49); 2.4753 (1.66); 2.4540 (1.18); 2.4290 (1.31); 2.4044 (0.90); 2.3789 (0.38); 1.6068 (3.27); 1.6000 (0.77); 1.5740 (2.25); 1.5497 (3.48); 1.5259 (2.64); 1.5019 (0.83); 1.0041 (5.27); 0.9922 (1.14); 0.9797 (10.74); 0.9678 (1.93); 0.9549 (4.45); 0.9434 (0.80); -0.0002 (2.67)

实施例 31, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.5469 (2.71); 7.3927 (1.58); 7.3733 (1.84); 7.2883 (1.78); 7.1699 (1.64); 7.1537 (5.05); 7.1318 (2.25); 7.0860 (2.62); 7.0683 (1.65); 7.0195 (2.01); 3.9296 (16.00); 3.4763 (0.61); 3.4696 (0.71); 3.4572 (0.94); 3.4518 (0.95); 3.4396 (0.80); 3.4326 (0.67); 3.3900 (0.35); 3.3404 (58.96); 3.0383 (0.37); 3.0172 (0.78); 2.9976 (0.90); 2.9772 (1.17); 2.9561 (0.63); 2.8381 (0.67); 2.8296 (0.76); 2.8158 (0.84); 2.8073 (0.82); 2.7985 (0.57); 2.7898 (0.57); 2.7759 (0.56); 2.7676 (0.51); 2.5306 (1.11); 2.5259 (1.60); 2.5172 (14.25); 2.5127 (29.38); 2.5082 (40.17); 2.5037 (29.10); 2.4992 (14.37); 2.4575 (0.50); 2.2306 (0.35); 2.2085 (0.92); 2.1995 (0.55); 2.1878 (1.01); 2.1771 (1.15); 2.1655 (0.48); 2.1566 (0.99); 2.1344 (0.35); 2.0822 (0.45); 1.7140 (0.44); 1.7060 (0.80); 1.6978 (0.61); 1.6942 (0.64); 1.6859 (0.95); 1.6750 (0.93); 1.6667 (0.62); 1.6630 (0.54); 1.6550 (0.72); 1.6467 (0.43); 1.1100 (9.64); 1.0927 (9.67)

实施例 32, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.3602 (3.60); 7.4242 (2.40); 7.4044 (2.80); 7.2808 (2.29); 7.1613 (2.06); 7.1465 (6.27); 7.1427 (4.65); 7.1229 (2.42); 7.0215 (3.95); 7.0124 (3.01);

[0429]

7.0032 (3.12); 3.8319 (16.00); 3.7933 (0.37); 3.3176 (29.90); 2.9755 (0.68); 2.9579 (2.22); 2.9402 (2.33); 2.9226 (0.78); 2.7789 (2.60); 2.7396 (4.09); 2.6119 (3.80); 2.5727 (2.50); 2.5301 (1.05); 2.5168 (16.44); 2.5123 (33.39); 2.5078 (45.57); 2.5033 (33.25); 2.4988 (16.84); 1.6811 (0.35); 1.6422 (6.23); 1.6333 (5.34); 1.6257 (3.98); 1.6048 (1.05); 1.5792 (1.11); 1.5621 (1.40); 1.5489 (2.49); 1.5312 (4.54); 1.2959 (1.37); 1.2801 (1.00); 1.2753 (0.96); 1.2657 (1.27); 1.2513 (0.57); 1.1321 (12.11); 1.1143 (12.15)

实施例 33, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.5515 (2.68); 7.4505 (1.14); 7.4310 (1.27); 7.2733 (1.50); 7.1649 (1.47); 7.1457 (3.08); 7.1389 (3.72); 7.1265 (1.80); 7.0244 (2.98); 7.0050 (3.62); 3.9233 (16.00); 3.3166 (36.49); 2.9762 (0.52); 2.9585 (1.70); 2.9408 (1.77); 2.9234 (0.60); 2.8077 (2.00); 2.7682 (3.16); 2.6767 (0.37); 2.6402 (2.92); 2.6008 (1.99); 2.5300 (1.55); 2.5167 (21.16); 2.5123 (42.57); 2.5077 (58.02); 2.5032 (42.22); 2.4987 (21.39); 2.3346 (0.40); 1.6422 (4.86); 1.6367 (4.27); 1.6253 (3.07); 1.6043 (0.80); 1.5752 (0.83); 1.5578 (1.10); 1.5465 (1.99); 1.5300 (3.27); 1.2954 (1.08); 1.2799 (0.77); 1.2646 (0.98); 1.1327 (9.32); 1.1149 (9.34)

实施例 34, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.5015 (3.75); 7.2863 (0.38); 7.2789 (2.18); 7.2306 (1.32); 7.2123 (3.46); 7.2011 (3.13); 7.1828 (3.64); 7.1638 (1.75); 7.1522 (0.94); 7.1447 (5.24); 7.1263 (0.33); 7.0738 (3.03); 7.0561 (2.33); 7.0179 (0.43); 7.0104 (2.51); 3.8370 (16.00); 3.3174 (23.46); 3.3087 (1.87); 3.2887 (1.58); 3.2705 (0.94); 3.2536 (0.33); 3.0680 (0.61); 3.0553 (0.76); 3.0472 (1.32); 3.0350 (1.40); 3.0271 (0.86); 3.0138 (0.77); 2.5300 (0.99); 2.5252 (1.50); 2.5166 (14.48); 2.5121 (29.68); 2.5075 (40.66); 2.5030 (29.35); 2.4985 (14.60); 2.4624 (0.86); 2.4575 (0.90); 2.4531 (0.83); 2.3146 (0.85); 2.2929 (1.61); 2.2823 (1.16); 2.2711 (1.05); 2.2606 (1.73); 2.2390 (1.06); 2.2243 (1.01); 2.2116 (1.08); 2.2073 (1.33); 2.1947 (1.39); 2.1906 (1.15); 2.1779 (0.99); 2.1610 (0.45); 1.3885 (0.89); 1.3694 (1.44); 1.3560 (1.04); 1.3506 (1.06); 1.3371 (1.39); 1.3181 (0.90); 1.2505 (0.73); 1.1741 (12.10); 1.1570 (12.13); 1.1244 (0.35); 1.1036 (1.05); 1.0919 (0.76); 1.0863 (1.04); 1.0746 (0.66); 1.0260 (10.62); 1.0090 (10.52); 0.9901 (0.98); 0.9732 (0.90); 0.9568 (0.54); 0.8828

[0430]

(0.37); 0.8661 (1.20); 0.8485 (0.47); 0.7566 (11.82); 0.7397 (11.77); 0.7076 (0.88); 0.6906 (0.78)

实施例 35, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.6579 (2.97); 7.2709 (1.53); 7.1954 (4.86); 7.1831 (3.75); 7.1695 (0.45); 7.1633 (0.56); 7.1506 (0.78); 7.1364 (3.26); 7.0803 (1.49); 7.0688 (1.97); 7.0600 (1.11); 7.0020 (1.71); 3.9288 (16.00); 3.3478 (0.64); 3.3303 (1.29); 3.3170 (29.37); 3.2928 (0.87); 3.0654 (0.45); 3.0523 (0.59); 3.0448 (0.98); 3.0324 (1.02); 3.0246 (0.67); 3.0117 (0.57); 2.5298 (0.88); 2.5252 (1.26); 2.5165 (11.21); 2.5120 (22.75); 2.5075 (30.99); 2.5029 (22.21); 2.4984 (11.00); 2.3168 (0.62); 2.2950 (1.18); 2.2846 (0.85); 2.2731 (0.77); 2.2627 (1.24); 2.2408 (0.69); 2.2349 (0.38); 2.2176 (0.68); 2.2007 (0.96); 2.1879 (0.98); 2.1839 (0.82); 2.1710 (0.69); 1.3980 (0.68); 1.3796 (1.07); 1.3654 (0.80); 1.3612 (0.80); 1.3472 (1.01); 1.3286 (0.66); 1.1882 (8.75); 1.1711 (8.74); 1.1137 (0.75); 1.1054 (0.50); 1.0964 (0.74); 1.0880 (0.45); 1.0282 (7.77); 1.0112 (7.67); 0.9968 (0.77); 0.9794 (0.54); 0.7642 (8.64); 0.7473 (8.57); 0.7062 (0.50); 0.6892 (0.45)

实施例 36, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 399,95 MHz

9.6307 (3.19); 7.4027 (2.55); 7.3816 (4.01); 7.3108 (3.61); 7.2897 (2.34); 7.2690 (1.55); 7.1345 (3.37); 7.0003 (1.68); 3.9201 (14.95); 3.4552 (0.54); 3.4445 (0.66); 3.4371 (0.74); 3.4337 (0.77); 3.4267 (0.77); 3.4230 (0.76); 3.4158 (0.70); 3.4055 (0.58); 3.3218 (115.39); 2.6748 (0.96); 2.6705 (1.28); 2.6660 (0.96); 2.5234 (4.24); 2.5100 (75.54); 2.5058 (146.54); 2.5013 (189.66); 2.4969 (138.17); 2.4928 (68.27); 2.3325 (0.91); 2.3281 (1.23); 2.3237 (0.90); 2.2182 (1.23); 2.1959 (1.35); 2.1858 (1.55); 2.1635 (1.32); 1.6703 (1.52); 1.6596 (1.53); 1.6377 (1.40); 1.6271 (1.45); 1.4705 (16.00); 1.3976 (0.74); 1.3798 (15.85); 1.3351 (0.32); 1.2492 (0.36); 1.1914 (8.86); 1.1739 (8.80); 0.0078 (2.33); -0.0002 (59.22); -0.0084 (2.24)

实施例 37, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.6396 (3.17); 7.2823 (1.27); 7.2695 (2.61); 7.2608 (1.43); 7.2495 (1.28); 7.1347 (3.38); 7.0115 (1.75); 7.0003 (1.93); 6.9877 (2.31); 6.9651 (1.42); 3.9261 (16.00); 3.4843 (0.61); 3.4653 (0.93); 3.4531 (0.90); 3.4329 (0.69); 3.3649 (0.73); 3.3141 (60.96); 3.2638 (0.72); 2.6815 (0.85); 2.6771 (1.11);

[0431]

2.5634 (1.83); 2.5590 (2.28); 2.5545 (1.79); 2.5500 (1.18); 2.5125 (143.15); 2.5081 (187.46); 2.5038 (136.72); 2.4624 (2.12); 2.4578 (2.45); 2.4534 (1.71); 2.3396 (0.88); 2.3349 (1.12); 2.3305 (0.85); 2.2188 (1.38); 2.1970 (1.51); 2.1865 (1.71); 2.1651 (1.53); 1.6342 (1.63); 1.6217 (1.62); 1.6018 (1.50); 1.5892 (1.48); 1.4267 (14.44); 1.3508 (0.55); 1.3194 (14.51); 1.2689 (0.41); 1.2557 (0.47); 1.2048 (9.23); 1.1874 (9.12)

实施例 38, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 399,95 MHz

9.4617 (2.71); 7.3939 (2.18); 7.3727 (4.35); 7.3326 (4.29); 7.3114 (2.27); 7.2699 (1.55); 7.1358 (3.47); 7.0016 (1.74); 3.9201 (0.35); 3.8285 (10.73); 3.4384 (0.51); 3.4267 (0.64); 3.4206 (0.70); 3.4167 (0.68); 3.4088 (0.69); 3.4046 (0.71); 3.3992 (0.62); 3.3873 (0.54); 3.3223 (38.36); 2.6751 (0.39); 2.6706 (0.52); 2.6659 (0.37); 2.5239 (1.52); 2.5191 (2.43); 2.5105 (29.33); 2.5060 (58.67); 2.5014 (76.99); 2.4969 (55.54); 2.4924 (26.48); 2.3327 (0.37); 2.3281 (0.51); 2.3237 (0.35); 2.2210 (1.26); 2.1987 (1.39); 2.1885 (1.60); 2.1664 (1.36); 1.6618 (1.52); 1.6502 (1.51); 1.6293 (1.41); 1.6178 (1.40); 1.4676 (16.00); 1.3977 (0.34); 1.3697 (15.62); 1.3357 (0.33); 1.2493 (0.33); 1.1917 (0.35); 1.1759 (8.92); 1.1584 (8.62); 0.0080 (0.63); -0.0002 (19.34); -0.0085 (0.62)

实施例 39, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.0240 (1.84); 7.9972 (1.99); 7.8828 (1.48); 7.3925 (0.92); 7.3892 (1.14); 7.3844 (0.76); 7.3681 (2.24); 7.3639 (2.89); 7.3507 (1.06); 7.3413 (3.72); 7.3150 (1.98); 7.3047 (2.21); 7.2956 (1.78); 7.2928 (1.96); 7.2768 (5.82); 7.2701 (3.80); 7.2583 (2.41); 7.2523 (3.63); 7.2369 (2.84); 7.2107 (1.64); 7.1833 (0.45); 7.1351 (3.71); 7.0745 (2.33); 7.0500 (1.79); 6.9554 (1.81); 4.2116 (0.34); 4.1878 (0.78); 4.1640 (0.80); 3.9759 (16.00); 3.1318 (0.55); 3.1115 (0.79); 3.0814 (0.94); 3.0621 (1.10); 3.0291 (0.66); 3.0084 (0.83); 2.9803 (0.71); 2.9586 (1.30); 2.9351 (0.40); 2.9288 (0.42); 2.9168 (0.40); 2.9073 (0.61); 2.8849 (0.84); 2.8595 (5.83); 2.8367 (1.23); 2.8200 (1.38); 2.8028 (0.79); 2.7692 (0.88); 2.7503 (0.70); 2.7075 (0.98); 2.6940 (0.94); 2.6600 (0.85); 2.6431 (0.73); 2.0993 (3.57); 1.7318 (0.65); 1.3687 (0.51); 1.3395 (2.14); 1.3290 (3.24); 1.3160 (3.36); 1.2920 (1.20); 0.9664 (1.11); 0.9446 (3.40); 0.9214 (1.32); 0.1449 (0.32); 0.0644 (0.63)

[0432]

实施例 40, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.9983 (1.92); 7.9714 (2.08); 7.8772 (1.39); 7.2658 (2.63); 7.2604 (8.96);
7.2408 (1.32); 7.2150 (2.48); 7.1888 (1.47); 7.0866 (3.54); 7.0303 (2.53);
7.0054 (1.99); 6.9069 (1.77); 3.9522 (16.00); 3.2505 (0.59); 3.2260 (0.72);
3.2174 (0.74); 3.2024 (0.66); 2.9214 (0.38); 2.9078 (0.38); 2.8859 (0.89);
2.8702 (0.94); 2.8567 (0.95); 2.8412 (0.93); 2.8215 (0.77); 2.7951 (1.55);
2.7692 (1.14); 2.7437 (0.66); 2.7174 (0.38); 2.4040 (0.39); 2.3885 (0.43);
2.3775 (0.74); 2.3622 (1.13); 2.3507 (0.64); 2.3469 (0.66); 2.3356 (1.16);
2.3204 (0.80); 2.3093 (0.49); 2.2938 (0.39); 1.7771 (0.82); 1.7654 (0.61);
1.7517 (1.53); 1.7353 (1.00); 1.7267 (1.61); 1.7240 (1.62); 1.7097 (1.33);
1.6996 (0.89); 1.6872 (1.69); 1.6721 (1.21); 1.6578 (0.80); 1.6448 (1.48);
1.6285 (1.22); 1.6152 (0.90); 1.5986 (0.87); 1.5741 (5.31); 1.4228 (0.52);
1.3902 (0.84); 1.3744 (0.94); 1.3572 (0.94); 1.3468 (1.01); 1.3411 (1.10);
1.3315 (0.82); 1.3137 (0.82); 1.2974 (0.79); 1.2545 (1.22); 1.1088 (0.62);
0.9917 (9.92); 0.9791 (10.97); 0.9704 (10.85); 0.9580 (10.48); 0.8818
(0.32); -0.0002 (5.41); -0.0108 (0.33)

实施例 41, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

9.3694 (4.22); 7.4470 (2.71); 7.4210 (3.31); 7.3276 (2.32); 7.1765 (1.76);
7.1490 (7.90); 7.1255 (2.30); 7.0373 (3.78); 7.0124 (2.65); 6.9699 (2.58);
3.8255 (16.00); 3.3284 (39.54); 3.2005 (0.33); 3.1765 (0.84); 3.1605 (1.09);
3.1431 (1.10); 3.1040 (0.41); 2.8749 (0.41); 2.8601 (0.53); 2.8466 (0.54);
2.8212 (1.12); 2.8058 (1.29); 2.7928 (1.25); 2.7776 (1.14); 2.7549 (0.93);
2.7283 (2.08); 2.7017 (1.44); 2.6746 (0.91); 2.6490 (0.49); 2.5072 (6.73);
2.5012 (9.00); 2.4952 (6.63); 2.3025 (0.44); 2.2865 (0.55); 2.2759 (0.93);
2.2608 (1.33); 2.2495 (0.92); 2.2348 (1.35); 2.2200 (0.94); 2.2090 (0.61);
2.1934 (0.43); 1.7582 (0.36); 1.7360 (0.68); 1.7289 (0.74); 1.7083 (1.02);
1.6920 (1.10); 1.6727 (1.85); 1.6574 (1.61); 1.6308 (1.82); 1.6140 (2.08);
1.6015 (1.34); 1.5849 (2.00); 1.5698 (1.31); 1.5585 (0.70); 1.5439 (1.08);
1.5170 (0.42); 1.3132 (0.77); 1.2986 (1.04); 1.2803 (1.05); 1.2713 (1.32);
1.2654 (1.36); 1.2575 (0.89); 1.2384 (1.00); 1.2230 (0.74); 0.9707 (12.36);
0.9606 (14.04); 0.9497 (13.46); 0.9399 (12.99); -0.0002 (5.84)

实施例 42, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

[0433]

9.6637 (2.20); 7.2662 (1.40); 7.2441 (1.69); 7.2181 (1.38); 7.1995 (1.96); 7.1804 (0.88); 7.1319 (2.05); 7.0631 (1.69); 7.0605 (1.72); 7.0449 (1.38); 7.0422 (1.33); 6.9975 (1.10); 5.7663 (1.24); 3.9499 (10.29); 3.4603 (0.37); 3.4426 (0.60); 3.4254 (0.62); 3.4081 (0.41); 3.3850 (0.88); 3.3824 (0.76); 3.3800 (1.06); 3.3441 (126.02); 3.3081 (0.95); 3.3032 (0.69); 2.5492 (0.56); 2.5447 (0.60); 2.5309 (0.54); 2.5261 (0.87); 2.5174 (14.09); 2.5129 (29.80); 2.5084 (40.80); 2.5039 (28.95); 2.4995 (13.41); 2.4721 (0.57); 2.4677 (0.52); 2.1758 (0.96); 2.1548 (1.08); 2.1441 (1.21); 2.1232 (1.02); 1.5718 (1.05); 1.5577 (1.06); 1.5401 (0.99); 1.5260 (0.98); 1.3167 (10.49); 1.2079 (6.45); 1.1906 (16.00)

实施例 43, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 400,13 MHz

8.0173 (1.78); 7.9971 (1.88); 7.9298 (1.28); 7.2644 (1.83); 7.2585 (1.89); 7.2525 (1.62); 7.2331 (2.85); 7.2135 (1.72); 7.1295 (3.55); 7.0076 (2.40); 6.9945 (2.12); 6.9890 (2.14); 3.9480 (16.00); 3.3914 (0.48); 3.3743 (0.78); 3.3659 (0.63); 3.3572 (0.64); 3.3485 (1.01); 3.3297 (1.31); 3.3109 (1.48); 3.2928 (0.97); 2.0567 (0.88); 2.0549 (0.88); 2.0390 (0.89); 2.0372 (0.92); 2.0258 (1.25); 2.0240 (1.25); 2.0081 (1.18); 2.0065 (1.19); 1.8866 (0.87); 1.8666 (0.96); 1.8608 (0.98); 1.8559 (0.78); 1.8409 (0.94); 1.8359 (0.76); 1.8300 (0.70); 1.8101 (0.60); 1.3036 (9.62); 1.2867 (9.49); 1.2544 (0.47); 1.2035 (8.97); 1.1858 (8.84); -0.0002 (0.92)

实施例 44, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 400,13 MHz

7.9052 (1.11); 7.7399 (1.70); 7.7200 (1.82); 7.2603 (5.61); 7.2514 (1.41); 7.2321 (2.69); 7.2126 (1.53); 7.1269 (3.31); 7.0573 (2.45); 7.0386 (2.01); 6.9920 (1.70); 5.2969 (0.44); 3.9576 (16.00); 3.3541 (0.54); 3.3365 (0.86); 3.3196 (0.88); 3.3023 (0.57); 3.2017 (0.49); 3.1840 (0.84); 3.1652 (0.87); 3.1477 (0.54); 2.6313 (0.93); 2.6102 (1.68); 2.5992 (1.07); 2.5890 (0.92); 2.5781 (1.74); 2.5569 (0.86); 1.5947 (2.28); 1.4024 (0.96); 1.3881 (1.70); 1.3738 (1.17); 1.3703 (1.11); 1.3559 (1.77); 1.3424 (11.38); 1.3248 (10.78); 1.3160 (10.97); 1.2987 (10.58); -0.0002 (3.16)

实施例 45, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.9276 (1.79); 7.9009 (1.96); 7.5991 (0.94); 7.2597 (2.84); 7.2435 (1.11); 7.2177 (2.15); 7.1916 (1.25); 7.1751 (1.53); 6.9957 (3.01); 6.9810 (2.35);

[0434]

6.9563 (1.94); 6.8164 (1.47); 3.8452 (9.45); 2.9209 (0.86); 2.8957 (0.98); 2.8705 (1.14); 2.8454 (1.20); 2.4782 (0.96); 2.4451 (1.22); 2.4278 (0.78); 2.3947 (1.04); 2.2239 (0.66); 2.2001 (0.98); 2.1911 (0.66); 2.1760 (0.78); 2.1678 (1.11); 2.1432 (0.55); 1.3032 (0.32); 1.2800 (16.00); 1.2554 (2.39); 1.0977 (8.23); 1.0745 (8.09); 0.9705 (14.82); 0.9424 (0.46); 0.9024 (0.34); 0.8810 (0.65); 0.8571 (0.47); -0.0002 (1.16)

实施例 46, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.9674 (1.65); 7.9406 (1.79); 7.8618 (0.97); 7.2675 (2.19); 7.2609 (25.87); 7.2307 (2.27); 7.2046 (1.27); 7.0882 (3.25); 6.9897 (2.26); 6.9651 (1.89); 6.9085 (1.69); 3.9568 (14.07); 2.9435 (0.87); 2.9186 (1.00); 2.8935 (1.16); 2.8681 (1.23); 2.4951 (0.96); 2.4615 (1.20); 2.4448 (0.79); 2.4117 (1.04); 2.2330 (0.65); 2.2090 (0.96); 2.2002 (0.64); 2.1850 (0.75); 2.1764 (0.81); 2.1520 (0.54); 1.5528 (20.48); 1.2854 (16.00); 1.1006 (8.34); 1.0775 (8.22); 0.9764 (14.97); 0.9498 (0.46); 0.0106 (0.48); -0.0002 (17.17); -0.0110 (0.89)

实施例 47, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 499,93 MHz

8.0140 (1.81); 7.9978 (1.95); 7.9042 (1.69); 7.2593 (4.26); 7.2082 (1.38); 7.1847 (1.47); 7.1692 (2.80); 7.1536 (1.72); 7.1002 (2.70); 7.0174 (2.51); 7.0027 (2.30); 6.9924 (1.69); 3.9533 (15.88); 3.2755 (0.33); 3.2618 (1.25); 3.2480 (1.92); 3.2342 (1.38); 3.2205 (0.47); 2.9087 (1.11); 2.8942 (1.26); 2.8781 (1.60); 2.8635 (1.61); 2.6959 (1.24); 2.6719 (1.47); 2.6665 (1.25); 2.6417 (1.06); 2.6102 (0.37); 2.0522 (0.41); 2.0378 (0.72); 2.0294 (0.84); 2.0245 (0.70); 2.0155 (1.34); 2.0064 (0.80); 2.0016 (0.93); 1.9930 (0.90); 1.9788 (0.50); 1.8082 (0.51); 1.7955 (0.97); 1.7826 (1.41); 1.7701 (1.49); 1.7607 (1.57); 1.7479 (1.44); 1.7352 (1.11); 1.6668 (0.33); 1.4749 (1.04); 1.2563 (1.31); 1.2460 (0.66); 1.2318 (0.51); 1.0349 (8.35); 1.0201 (16.00); 1.0080 (14.65); 0.9964 (9.70); 0.8808 (0.64); 0.8674 (0.57); 0.8606 (0.37); 0.8502 (0.63); 0.8372 (0.60); -0.0002 (1.98)

实施例 48, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 499,93 MHz

7.8870 (3.70); 7.8703 (2.42); 7.2583 (1.44); 7.2174 (1.38); 7.1844 (1.53); 7.1692 (2.85); 7.1536 (1.62); 7.1094 (2.66); 7.0093 (3.03); 7.0010 (2.47); 6.9955 (2.58); 3.9492 (16.00); 3.1850 (1.28); 3.1679 (1.90); 3.1518 (2.96);

[0435]

3.1362 (2.71); 2.7288 (1.76); 2.7232 (1.71); 2.6957 (1.52); 2.6900 (1.46);
1.9040 (1.71); 1.6921 (0.43); 1.6790 (1.02); 1.6659 (1.59); 1.6527 (1.59);
1.6395 (1.00); 1.6264 (0.40); 1.4748 (0.36); 1.2460 (8.95); 1.2322 (8.65);
0.8802 (9.26); 0.8668 (9.11); 0.8496 (9.46); 0.8363 (8.78); -0.0002 (0.76)

实施例 49, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

11.6451 (2.80); 7.3195 (1.75); 7.2153 (1.54); 7.1961 (3.53); 7.1848 (3.98);
7.1771 (2.29); 7.0645 (3.15); 7.0502 (2.34); 7.0456 (2.57); 6.7138 (2.74);
6.6956 (2.57); 4.0380 (0.34); 4.0203 (0.34); 3.9430 (0.49); 3.9158 (16.00);
3.4962 (0.59); 3.4885 (0.70); 3.4758 (0.89); 3.4709 (0.89); 3.4583 (0.72);
3.4503 (0.60); 3.3080 (30.29); 2.5084 (3.24); 2.5040 (6.55); 2.4995 (8.84);
2.4950 (6.28); 2.4906 (2.98); 2.4368 (1.33); 2.4156 (1.43); 2.4052 (1.57);
2.3841 (1.35); 1.9874 (1.51); 1.6070 (1.61); 1.5988 (1.62); 1.5753 (1.52);
1.5671 (1.50); 1.2426 (1.14); 1.2237 (0.46); 1.1924 (9.45); 1.1750 (9.58);
1.1565 (0.61); 1.1528 (0.37); 1.0087 (1.11); 1.0033 (1.94); 0.9938 (1.59);
0.9874 (2.22); 0.9816 (2.47); 0.9727 (1.56); 0.9663 (0.87); 0.9508 (0.40);
0.9165 (0.50); 0.8994 (0.62); 0.8926 (1.42); 0.8845 (1.62); 0.8795 (1.09);
0.8720 (2.87); 0.8678 (2.13); 0.8583 (2.07); 0.8513 (2.05); 0.8464 (1.34);
0.8409 (0.95); -0.0002 (2.99)

实施例 50, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.3819 (3.86); 7.3607 (2.83); 7.3410 (3.40); 7.2892 (2.51); 7.1550 (5.71);
7.1467 (2.87); 7.1275 (4.80); 7.1081 (2.48); 7.0208 (2.80); 6.5857 (3.50);
6.5840 (3.83); 6.5670 (3.49); 6.5653 (3.52); 3.8389 (16.00); 3.5263 (0.77);
3.5190 (0.96); 3.5055 (1.23); 3.5019 (1.24); 3.4884 (1.05); 3.4808 (0.89);
3.4714 (0.36); 3.3165 (31.72); 2.5303 (0.74); 2.5256 (1.28); 2.5169 (16.62);
2.5124 (34.98); 2.5079 (48.63); 2.5033 (35.73); 2.4988 (18.17); 2.4623
(2.53); 2.4409 (2.15); 2.4305 (2.33); 2.4094 (1.94); 2.3347 (0.33); 1.6019
(2.22); 1.5941 (2.30); 1.5702 (2.14); 1.5625 (2.17); 1.1823 (12.89); 1.1650
(13.00); 1.0069 (0.56); 0.9942 (1.27); 0.9878 (2.16); 0.9742 (6.04); 0.9610
(2.58); 0.9519 (2.07); 0.9462 (1.04); 0.9386 (1.21); 0.8980 (0.67); 0.8812
(1.19); 0.8750 (1.72); 0.8659 (2.09); 0.8528 (1.44); 0.8454 (1.79); 0.8360
(2.15); 0.8315 (1.84); 0.8154 (2.40); 0.8093 (1.44); 0.8006 (1.02); 0.7859
(0.42)

[0436]

实施例 51, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.5509 (2.91); 7.3491 (1.94); 7.3296 (2.34); 7.2877 (1.79); 7.1530 (5.18); 7.1324 (3.36); 7.1130 (1.70); 7.0188 (1.98); 6.5920 (2.69); 6.5745 (2.54); 3.9314 (16.00); 3.5429 (0.57); 3.5366 (0.70); 3.5216 (0.93); 3.5050 (0.73); 3.4983 (0.59); 3.3156 (30.63); 2.5298 (0.70); 2.5164 (16.88); 2.5120 (34.26); 2.5074 (46.16); 2.5029 (32.27); 2.4985 (14.93); 2.4710 (1.44); 2.4500 (1.51); 2.4395 (1.58); 2.4184 (1.33); 1.5853 (1.65); 1.5784 (1.64); 1.5537 (1.55); 1.5468 (1.52); 1.1969 (9.30); 1.1796 (9.23); 1.0192 (0.42); 1.0140 (0.34); 1.0054 (1.03); 0.9990 (1.61); 0.9902 (2.73); 0.9853 (2.44); 0.9774 (1.85); 0.9685 (1.63); 0.9545 (0.73); 0.8911 (0.50); 0.8739 (0.76); 0.8674 (1.53); 0.8590 (1.29); 0.8462 (1.09); 0.8384 (1.10); 0.8249 (1.37); 0.8200 (1.23); 0.8044 (1.65); 0.7979 (1.08); 0.7892 (0.58)

实施例 52, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz

8.0086 (1.68); 7.9819 (1.82); 7.8668 (1.11); 7.2735 (1.44); 7.2590 (2.80); 7.2288 (2.10); 7.2027 (1.19); 7.0937 (2.86); 6.9394 (2.28); 6.9141 (3.34); 3.9474 (13.45); 2.8489 (1.84); 2.8246 (3.73); 2.8005 (2.13); 2.1302 (0.55); 2.1070 (1.08); 2.0875 (1.01); 2.0645 (1.49); 2.0414 (0.71); 1.9232 (0.80); 1.8984 (1.40); 1.8807 (0.70); 1.8726 (0.83); 1.8556 (1.12); 1.8303 (0.52); 1.6687 (0.38); 1.6480 (0.60); 1.6442 (0.56); 1.6230 (1.91); 1.5976 (3.04); 1.5724 (2.10); 1.5491 (0.72); 1.5265 (0.42); 1.2337 (16.00); 0.8540 (4.10); 0.8293 (8.34); 0.8044 (3.64); -0.0002 (1.58)

实施例 53, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz

7.9677 (1.62); 7.9410 (1.76); 7.5975 (0.84); 7.2596 (3.75); 7.2469 (1.02); 7.2211 (1.92); 7.1950 (1.10); 7.1665 (1.35); 6.9872 (2.62); 6.9327 (2.03); 6.9081 (1.73); 6.8078 (1.30); 3.8469 (8.54); 2.8269 (1.65); 2.8025 (3.33); 2.7784 (1.89); 2.1249 (0.52); 2.1017 (1.03); 2.0824 (0.92); 2.0591 (1.47); 2.0360 (0.67); 1.9184 (0.78); 1.8936 (1.31); 1.8761 (0.64); 1.8679 (0.79); 1.8509 (1.10); 1.8255 (0.49); 1.6656 (0.38); 1.6452 (0.55); 1.6408 (0.53); 1.6199 (1.74); 1.5940 (2.78); 1.5684 (1.94); 1.5441 (0.67); 1.5226 (0.42); 1.2300 (16.00); 0.8684 (0.34); 0.8516 (4.02); 0.8268 (8.35); 0.8019 (3.53); -0.0002 (2.47)

实施例 54, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 499,93 MHz

[0437]

7.9109 (1.80); 7.8947 (2.00); 7.8720 (1.52); 7.2523 (1.50); 7.1943 (1.39); 7.1868 (1.76); 7.1790 (2.57); 7.1635 (1.39); 7.0789 (2.96); 6.9708 (1.74); 6.9634 (2.50); 6.9487 (2.06); 3.9424 (0.60); 3.9254 (16.00); 3.8165 (0.83); 2.8179 (1.17); 2.8048 (1.27); 2.7894 (1.41); 2.7764 (1.38); 2.4623 (0.55); 2.4435 (1.17); 2.4398 (1.17); 2.4131 (1.66); 2.3887 (1.44); 2.3609 (1.14); 2.3452 (0.96); 2.3400 (1.00); 2.3211 (0.98); 2.3155 (0.93); 1.9926 (0.90); 1.9879 (0.97); 1.9778 (0.66); 1.9684 (1.05); 1.9635 (1.05); 1.9055 (0.86); 1.8804 (1.17); 1.8652 (1.06); 1.8395 (0.92); 1.7937 (0.45); 1.7848 (0.46); 1.7791 (0.42); 1.7715 (0.40); 1.7615 (0.70); 1.7555 (0.67); 1.7484 (0.67); 1.7422 (0.74); 1.7386 (0.75); 1.7324 (0.66); 1.7254 (0.64); 1.7193 (0.63); 1.4916 (0.33); 1.4741 (0.95); 1.4677 (0.87); 1.4499 (1.24); 1.4438 (0.99); 1.4246 (1.05); 1.4055 (0.73); 1.3991 (1.09); 1.3933 (0.68); 1.3759 (1.32); 1.3529 (1.52); 1.3469 (1.17); 1.3286 (1.48); 1.3239 (1.49); 1.3057 (0.94); 1.2999 (1.04); 1.2820 (0.35); 1.2751 (0.34); 1.2575 (0.34); -0.0002 (0.87)

实施例 55, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 399,95 MHz

11.5218 (2.51); 7.4590 (2.38); 7.4482 (1.46); 7.4382 (2.66); 7.3733 (0.50); 7.3325 (0.51); 7.3136 (2.59); 7.1794 (1.37); 7.1360 (0.36); 7.0733 (2.63); 7.0524 (2.36); 3.9451 (0.34); 3.8291 (11.21); 3.3770 (0.60); 3.3595 (1.05); 3.3237 (40.03); 2.6747 (0.48); 2.6704 (0.63); 2.6659 (0.46); 2.5233 (2.16); 2.5098 (38.95); 2.5057 (74.53); 2.5012 (95.59); 2.4968 (69.21); 2.4926 (34.06); 2.3324 (0.47); 2.3280 (0.62); 2.3234 (0.45); 2.2019 (1.20); 2.1802 (1.37); 2.1696 (1.49); 2.1481 (1.24); 1.6577 (1.37); 1.6431 (1.35); 1.6254 (1.28); 1.6109 (1.19); 1.4924 (16.00); 1.4675 (1.84); 1.4339 (1.21); 1.3975 (2.31); 1.3695 (1.78); 1.3387 (12.50); 1.2981 (0.42); 1.2583 (0.59); 1.2489 (1.27); 1.2440 (2.17); 1.2356 (2.27); 1.1756 (1.17); 1.1580 (1.39); 1.1454 (6.86); 1.1281 (6.66); 0.0077 (0.70); -0.0002 (17.88); -0.0083 (0.67)

实施例 56, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 499,93 MHz

8.0140 (1.81); 7.9978 (1.95); 7.9042 (1.69); 7.2593 (4.26); 7.2082 (1.38); 7.1847 (1.47); 7.1692 (2.80); 7.1536 (1.72); 7.1002 (2.70); 7.0174 (2.51); 7.0027 (2.30); 6.9924 (1.69); 3.9533 (15.88); 3.2755 (0.33); 3.2618 (1.25); 3.2480 (1.92); 3.2342 (1.38); 3.2205 (0.47); 2.9087 (1.11); 2.8942 (1.26); 2.8781 (1.60); 2.8635 (1.61); 2.6959 (1.24); 2.6719 (1.47); 2.6665 (1.25);

[0438]

2.6417 (1.06); 2.6102 (0.37); 2.0522 (0.41); 2.0378 (0.72); 2.0294 (0.84);
2.0245 (0.70); 2.0155 (1.34); 2.0064 (0.80); 2.0016 (0.93); 1.9930 (0.90);
1.9788 (0.50); 1.8082 (0.51); 1.7955 (0.97); 1.7826 (1.41); 1.7701 (1.49);
1.7607 (1.57); 1.7479 (1.44); 1.7352 (1.11); 1.6668 (0.33); 1.4749 (1.04);
1.2563 (1.31); 1.2460 (0.66); 1.2318 (0.51); 1.0349 (8.35); 1.0201 (16.00);
1.0080 (14.65); 0.9964 (9.70); 0.8808 (0.64); 0.8674 (0.57); 0.8606 (0.37);
0.8502 (0.63); 0.8372 (0.60); -0.0002 (1.98)

实施例 57, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 400,13 MHz

7.9510 (1.62); 7.9309 (1.69); 7.8468 (1.09); 7.2583 (10.39); 7.2051 (1.69);
7.1912 (1.21); 7.1718 (2.46); 7.1524 (1.40); 7.0702 (3.48); 7.0208 (2.20);
7.0024 (1.72); 6.9354 (1.70); 4.3654 (0.35); 4.3475 (0.36); 3.9489 (16.00);
3.9186 (1.08); 3.0936 (0.99); 3.0735 (1.08); 3.0542 (1.26); 3.0342 (1.31);
2.9999 (0.98); 2.9797 (1.10); 2.9616 (1.22); 2.9415 (1.26); 2.7319 (0.92);
2.7099 (1.02); 2.6925 (0.74); 2.6706 (0.84); 2.6013 (0.94); 2.5801 (1.10);
2.5631 (0.78); 2.5419 (0.94); 2.3564 (0.71); 2.3353 (1.26); 2.3141 (1.18);
2.2930 (0.57); 1.9093 (0.37); 1.8907 (0.87); 1.8720 (1.00); 1.8522 (1.40);
1.8381 (1.32); 1.8294 (1.12); 1.8177 (0.95); 1.8091 (1.05); 1.8061 (1.03);
1.8033 (1.00); 1.7854 (0.49); 1.6710 (0.79); 1.6628 (1.08); 1.6542 (1.51);
1.6514 (1.38); 1.6425 (1.10); 1.6361 (1.09); 1.6253 (0.84); 1.6141 (0.59);
1.5994 (0.72); 1.5849 (0.76); 1.5757 (1.10); 1.5655 (1.38); 1.5565 (7.11);
1.5484 (1.16); 1.5399 (0.87); 1.5290 (0.47); 1.3955 (0.40); 1.3777 (0.78);
1.3598 (0.39); 1.2580 (0.69); 1.2404 (1.05); 1.2221 (1.21); 1.2135 (1.06);
1.1935 (0.84); -0.0002 (5.91)

实施例 58, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.0736 (1.22); 8.0472 (1.35); 7.6808 (0.65); 7.5336 (1.19); 7.5312 (1.19);
7.5079 (1.58); 7.3373 (1.13); 7.3111 (1.86); 7.2849 (0.89); 7.2611 (18.26);
7.1609 (0.96); 6.9815 (1.95); 6.8022 (0.97); 5.3006 (0.63); 3.9925 (16.00);
3.8679 (6.30); 3.4760 (0.41); 3.4542 (0.62); 3.4320 (0.46); 3.1152 (0.93);
3.0878 (0.84); 3.0528 (1.26); 3.0255 (1.05); 2.6593 (1.36); 2.6525 (1.31);
2.5970 (1.06); 2.5902 (1.03); 1.5510 (9.08); 1.2737 (5.53); 1.2505 (5.57);
0.0106 (0.59); -0.0002 (17.01); -0.0111 (0.69)

实施例 59, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

[0439]

9.7209 (1.61); 8.0575 (1.28); 8.0383 (1.33); 7.7666 (0.72); 7.7468 (0.79); 7.3657 (0.81); 7.3460 (1.49); 7.3263 (0.68); 7.2966 (0.91); 7.1623 (1.92); 7.0281 (0.93); 3.9331 (7.94); 3.9157 (11.91); 3.8669 (0.68); 3.3170 (1.97); 2.8857 (4.47); 2.5165 (3.72); 2.5121 (7.63); 2.5076 (10.43); 2.5032 (7.57); 2.4988 (3.66); 1.4219 (0.93); 1.2485 (16.00)

实施例 60, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 400,13 MHz

8.9135 (2.49); 7.5175 (0.35); 7.4493 (2.56); 7.4303 (2.92); 7.3778 (0.51); 7.3577 (0.39); 7.3096 (0.46); 7.2588 (51.66); 7.2341 (2.16); 7.2161 (3.20); 7.1992 (1.80); 7.1360 (2.13); 7.0014 (4.13); 6.9782 (0.97); 6.8667 (2.07); 6.6526 (4.06); 6.6341 (3.86); 6.1234 (0.43); 5.2973 (2.33); 3.9132 (0.68); 3.8855 (0.95); 3.8361 (16.00); 3.6450 (0.33); 3.6344 (0.32); 3.4672 (1.87); 3.4604 (2.15); 3.4477 (2.91); 3.4429 (2.90); 3.4298 (2.24); 3.4234 (1.94); 2.5678 (3.86); 2.5469 (4.14); 2.5363 (4.74); 2.5155 (4.19); 1.7200 (0.37); 1.6693 (0.43); 1.6387 (4.35); 1.6314 (4.27); 1.6071 (4.06); 1.5999 (3.94); 1.5413 (32.29); 1.2913 (3.11); 1.2719 (7.34); 1.2636 (13.53); 1.2535 (9.96); 1.2466 (13.18); 1.1600 (0.37); 1.1413 (0.44); 1.0641 (0.36); 1.0331 (0.87); 1.0107 (8.66); 0.9946 (11.76); 0.9799 (2.92); 0.9679 (1.59); 0.9559 (1.95); 0.9393 (1.56); 0.9338 (1.71); 0.9144 (2.95); 0.9017 (8.55); 0.8987 (9.08); 0.8947 (8.47); 0.8875 (6.65); 0.8779 (8.71); 0.8625 (1.78); 0.8487 (0.66); -0.0002 (40.01); -0.0083 (2.10)

实施例 61, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.5229 (1.54); 8.0528 (1.26); 8.0349 (1.33); 7.7343 (1.08); 7.7152 (1.21); 7.3608 (0.86); 7.3411 (1.57); 7.3214 (0.75); 7.2940 (0.92); 7.1599 (2.05); 7.0259 (0.96); 3.9142 (12.15); 3.8660 (0.82); 3.8415 (6.10); 3.3162 (3.54); 2.8571 (4.49); 2.5300 (0.37); 2.5253 (0.54); 2.5167 (5.37); 2.5122 (11.04); 2.5076 (15.14); 2.5031 (11.02); 2.4987 (5.59); 1.4203 (1.00); 1.2468 (16.00)

实施例 62, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.5396 (2.50); 7.4569 (1.15); 7.4378 (1.29); 7.2750 (1.56); 7.1696 (1.44); 7.1505 (2.93); 7.1407 (3.57); 7.1313 (1.77); 7.0388 (2.95); 7.0202 (2.20); 7.0063 (1.72); 3.9167 (16.00); 3.3614 (0.40); 3.3105 (257.89); 3.2878 (0.75); 3.2609 (1.25); 3.1551 (0.91); 3.1378 (1.42); 3.1199 (0.96); 2.9296

[0440]

(0.42); 2.9184 (1.33); 2.8976 (1.47); 2.8822 (0.54); 2.8726 (0.45); 2.6738 (0.59); 2.6692 (0.81); 2.6647 (0.60); 2.5497 (0.67); 2.5325 (1.28); 2.5091 (51.77); 2.5047 (103.35); 2.5002 (136.64); 2.4957 (96.45); 2.4913 (46.03); 2.4722 (2.64); 2.4554 (1.82); 2.3315 (0.66); 2.3270 (0.89); 2.3227 (0.64); 1.0860 (9.49); 1.0680 (9.39); 0.9327 (7.56); 0.9158 (7.45); 0.0080 (1.25); -0.0002 (32.42); -0.0085 (1.30)

实施例 63, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.7439 (1.48); 9.6958 (0.48); 8.0549 (1.18); 8.0367 (1.24); 7.7686 (0.62); 7.7488 (0.68); 7.3638 (0.83); 7.3438 (1.67); 7.3337 (0.60); 7.3248 (0.67); 7.3143 (0.39); 7.2950 (0.50); 7.2844 (0.80); 7.2783 (0.42); 7.2009 (1.07); 7.1500 (1.80); 7.1441 (0.75); 7.0682 (0.53); 7.0156 (0.88); 7.0098 (0.37); 3.9553 (8.30); 3.9478 (5.17); 3.9160 (11.26); 3.8672 (4.02); 3.3170 (3.15); 2.9057 (4.39); 2.5165 (4.33); 2.5120 (8.86); 2.5075 (12.00); 2.5030 (8.48); 2.4986 (3.95); 1.9951 (0.59); 1.4234 (5.86); 1.2500 (16.00); 1.1820 (0.34); 0.8815 (0.47); 0.8647 (1.54); 0.8470 (0.59)

实施例 64, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.6632 (3.13); 7.2699 (1.71); 7.1898 (1.11); 7.1883 (1.11); 7.1700 (2.83); 7.1517 (2.26); 7.1504 (2.22); 7.1356 (3.68); 7.0741 (3.39); 7.0663 (3.93); 7.0566 (2.13); 7.0544 (2.18); 7.0482 (2.71); 7.0455 (2.16); 7.0015 (1.96); 5.7526 (7.09); 3.8318 (11.05); 3.3084 (104.16); 3.2590 (0.34); 2.8129 (0.74); 2.7966 (0.91); 2.7884 (0.94); 2.7719 (0.85); 2.5091 (6.48); 2.5046 (13.32); 2.5000 (18.38); 2.4955 (13.15); 2.4909 (6.53); 2.0718 (1.19); 1.5551 (1.14); 1.5478 (0.46); 1.5377 (1.34); 1.5304 (1.25); 1.5209 (0.57); 1.5130 (1.24); 1.4961 (0.38); 1.2671 (16.00); 1.1461 (9.73); 1.1296 (9.69); 1.0310 (8.93); 1.0137 (8.46); 0.8896 (13.05); 0.0081 (0.46); -0.0002 (13.67); -0.0085 (0.60)

实施例 65, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

9.8516 (0.63); 7.1960 (0.53); 7.1712 (0.45); 7.1408 (0.52); 7.0903 (0.85); 7.0814 (0.61); 7.0687 (0.46); 7.0650 (0.45); 7.0560 (0.38); 3.9704 (3.05); 3.3475 (16.00); 3.3253 (0.87); 2.5370 (1.85); 2.5309 (4.10); 2.5248 (5.74); 2.5187 (4.21); 2.5127 (2.03); 1.3786 (0.41); 1.3208 (0.45); 1.2938 (2.96); 1.2075 (1.99); 1.1854 (1.76); 1.0587 (1.65); 1.0355 (1.65); 1.0088 (0.45);

[0441]

0.9172 (2.40); 0.8561 (0.69)**实施例 66, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz**

**7.9983 (1.92); 7.9714 (2.08); 7.8772 (1.39); 7.2658 (2.63); 7.2604 (8.96);
7.2408 (1.32); 7.2150 (2.48); 7.1888 (1.47); 7.0866 (3.54); 7.0303 (2.53);
7.0054 (1.99); 6.9069 (1.77); 3.9522 (16.00); 3.2505 (0.59); 3.2260 (0.72);
3.2174 (0.74); 3.2024 (0.66); 2.9214 (0.38); 2.9078 (0.38); 2.8859 (0.89);
2.8702 (0.94); 2.8567 (0.95); 2.8412 (0.93); 2.8215 (0.77); 2.7951 (1.55);
2.7692 (1.14); 2.7437 (0.66); 2.7174 (0.38); 2.4040 (0.39); 2.3885 (0.43);
2.3775 (0.74); 2.3622 (1.13); 2.3507 (0.64); 2.3469 (0.66); 2.3356 (1.16);
2.3204 (0.80); 2.3093 (0.49); 2.2938 (0.39); 1.7771 (0.82); 1.7654 (0.61);
1.7517 (1.53); 1.7353 (1.00); 1.7267 (1.61); 1.7240 (1.62); 1.7097 (1.33);
1.6996 (0.89); 1.6872 (1.69); 1.6721 (1.21); 1.6578 (0.80); 1.6448 (1.48);
1.6285 (1.22); 1.6152 (0.90); 1.5986 (0.87); 1.5741 (5.31); 1.4228 (0.52);
1.3902 (0.84); 1.3744 (0.94); 1.3572 (0.94); 1.3468 (1.01); 1.3411 (1.10);
1.3315 (0.82); 1.3137 (0.82); 1.2974 (0.79); 1.2545 (1.22); 1.1088 (0.62);
0.9917 (9.92); 0.9791 (10.97); 0.9704 (10.85); 0.9580 (10.48); 0.8818
(0.32); -0.0002 (5.41); -0.0108 (0.33)**

实施例 67, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz

**8.0389 (0.38); 8.0137 (0.40); 7.2771 (0.52); 7.2606 (5.63); 7.1891 (0.61);
7.1634 (0.54); 7.1445 (0.73); 7.0973 (0.97); 6.9175 (0.47); 3.9545 (4.08);
2.8257 (0.39); 2.1895 (0.41); 2.1610 (0.53); 2.1493 (0.34); 2.1337 (0.34);
2.1209 (0.35); 1.5648 (0.35); 1.0421 (0.42); 0.9502 (16.00); -0.0002 (4.91)**

实施例 68, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

**9.5818 (1.66); 7.4486 (0.70); 7.4220 (0.83); 7.3033 (0.91); 7.1853 (0.83);
7.1599 (1.61); 7.1337 (1.04); 7.1240 (2.01); 7.0073 (1.57); 6.9823 (1.24);
6.9447 (0.95); 3.9397 (8.93); 3.3234 (16.00); 3.0096 (0.49); 2.9842 (0.59);
2.9552 (0.67); 2.9307 (0.63); 2.5386 (0.56); 2.5129 (1.61); 2.5069 (3.69);
2.5009 (4.79); 2.4948 (3.38); 2.4887 (1.83); 2.4511 (0.56); 1.9886 (0.51);
1.8083 (0.34); 1.8006 (0.40); 1.7787 (0.56); 1.7581 (0.48); 1.7445 (0.58);
1.7200 (0.64); 1.7126 (0.73); 1.6878 (0.57); 1.3701 (9.16); 1.3555 (1.87);
1.2991 (0.48); 1.1978 (0.56); 1.1743 (0.33); 1.0590 (4.39); 1.0396 (10.45);
0.9981 (0.49); 0.9685 (0.39); 0.9566 (0.34); 0.9245 (4.32); 0.9034 (4.30);**

[0442]

-0.0002 (2.68)**实施例 69, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz**

9.6835 (1.02); 7.2686 (0.48); 7.1998 (1.66); 7.1922 (0.83); 7.1861 (0.97);
 7.1340 (0.99); 7.0623 (0.44); 7.0543 (0.33); 7.0495 (0.43); 7.0421 (0.36);
 6.9996 (0.53); 3.9285 (4.63); 3.3272 (0.39); 3.3149 (3.75); 2.6124 (0.39);
 2.5809 (0.38); 2.5165 (5.07); 2.5120 (10.22); 2.5075 (13.76); 2.5030 (9.61);
 2.4985 (4.41); 1.9008 (0.40); 1.8960 (0.40); 1.8663 (0.47); 1.8615 (0.45);
 1.4062 (0.38); 1.3821 (0.39); 1.3717 (0.36); 1.3475 (0.36); 1.3216 (0.38);
 1.2899 (0.39); 1.1866 (2.73); 1.1696 (2.67); 1.0048 (16.00)

实施例 70, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.5320 (0.94); 7.2759 (0.48); 7.2158 (0.81); 7.2023 (0.68); 7.1840 (0.84);
 7.1647 (0.35); 7.1416 (1.07); 7.0565 (0.67); 7.0386 (0.53); 7.0074 (0.55);
 3.8368 (3.51); 3.3156 (3.16); 3.3046 (0.38); 3.2866 (0.36); 2.6192 (0.37);
 2.5877 (0.38); 2.5165 (4.04); 2.5120 (8.29); 2.5075 (11.23); 2.5030 (7.94);
 2.4986 (3.71); 1.9102 (0.42); 1.9054 (0.43); 1.8757 (0.47); 1.8709 (0.46);
 1.3910 (0.38); 1.3669 (0.38); 1.3566 (0.37); 1.3322 (0.38); 1.3088 (0.39);
 1.2772 (0.38); 1.1726 (2.70); 1.1556 (2.71); 1.0036 (16.00)

实施例 71, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.5522 (1.26); 7.4516 (0.54); 7.4320 (0.62); 7.2653 (0.63); 7.1456 (0.63);
 7.1303 (1.77); 7.1073 (0.80); 7.0333 (1.22); 7.0150 (0.89); 6.9962 (0.73);
 3.9457 (7.15); 3.3157 (3.32); 2.7246 (3.99); 2.6909 (4.15); 2.5164 (5.33);
 2.5122 (10.72); 2.5078 (14.61); 2.5034 (10.98); 2.4994 (5.82); 1.1194
 (16.00)

实施例 72, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.3537 (1.22); 7.4276 (0.82); 7.4079 (0.93); 7.2842 (0.76); 7.1499 (1.78);
 7.1444 (0.76); 7.1252 (1.31); 7.1058 (0.80); 7.0334 (1.21); 7.0157 (1.66);
 3.8311 (5.54); 3.3165 (2.39); 2.7261 (3.93); 2.6389 (4.07); 2.5162 (3.81);
 2.5119 (7.50); 2.5074 (9.95); 2.5030 (7.04); 2.4987 (3.32); 1.1164 (16.00)

实施例 73, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.5378 (1.09); 7.4514 (0.49); 7.4320 (0.56); 7.2790 (0.68); 7.1447 (1.77);
 7.1288 (1.22); 7.1094 (0.77); 7.0363 (1.13); 7.0178 (0.84); 7.0103 (0.85);
 3.9233 (6.87); 3.3162 (3.03); 2.7256 (3.71); 2.6711 (3.93); 2.5167 (3.95);

[0443]

2.5123 (8.08); 2.5077 (11.12); 2.5032 (8.12); 2.4987 (4.11); 1.1179 (16.00)

实施例 74, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.8524 (0.47); 7.6767 (0.68); 7.6513 (0.78); 7.3152 (0.50); 7.2904 (0.97);
7.2589 (2.32); 7.2264 (0.82); 7.2010 (0.36); 7.1844 (0.54); 7.0043 (0.93);
6.8242 (0.47); 3.9168 (4.70); 3.0411 (0.42); 3.0300 (0.49); 3.0137 (0.52);
3.0024 (0.53); 2.9083 (0.40); 2.8809 (0.52); 2.7911 (0.37); 2.7792 (0.42);
2.7623 (0.40); 2.7501 (0.40); 2.1667 (0.79); 2.1382 (0.99); 2.1323 (0.73);
2.1168 (0.58); 2.1099 (0.57); 2.1031 (0.59); 2.0896 (0.41); 1.5660 (1.07);
0.9566 (16.00); -0.0002 (1.27)

实施例 75, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.9351 (0.39); 7.6271 (0.51); 7.6022 (0.60); 7.3060 (0.46); 7.2810 (0.91);
7.2595 (3.51); 7.2436 (0.57); 7.2178 (0.67); 7.1260 (0.53); 6.9464 (1.01);
6.7668 (0.52); 5.2972 (1.05); 3.9122 (0.36); 3.8233 (3.13); 3.0354 (0.46);
3.0238 (0.54); 3.0075 (0.57); 2.9957 (0.57); 2.8875 (0.34); 2.8596 (0.43);
2.7731 (0.39); 2.7604 (0.44); 2.7435 (0.47); 2.7311 (0.49); 2.1876 (0.34);
2.1585 (0.90); 2.1302 (1.08); 2.1203 (0.73); 2.1041 (0.64); 2.0918 (0.70);
2.0783 (0.49); 1.5602 (1.20); 0.9534 (16.00); 0.9026 (0.44); -0.0002 (2.02)

实施例 76, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.9485 (1.16); 7.9299 (2.35); 7.9029 (2.23); 7.2791 (1.90); 7.2596 (5.52);
7.2064 (1.62); 7.1805 (2.89); 7.1542 (1.66); 7.0990 (3.88); 6.9191 (1.95);
6.5119 (2.48); 6.4881 (2.31); 3.9967 (16.00); 3.4451 (0.76); 3.4223 (1.14);
3.3997 (0.81); 3.0089 (1.88); 2.6595 (1.33); 2.6320 (1.32); 2.6177 (1.56);
2.5902 (1.39); 1.5920 (2.45); 1.5862 (2.83); 1.5503 (1.83); 1.5443 (1.78);
1.3262 (0.79); 1.3092 (9.40); 1.2861 (9.30); 1.2650 (0.37); 1.2587 (0.40);
1.0580 (0.46); 1.0455 (0.72); 1.0294 (1.83); 1.0203 (2.78); 1.0077 (2.90);
0.9882 (1.28); 0.9757 (0.93); 0.9083 (0.33); 0.8796 (0.80); 0.8721 (0.94);
0.8624 (0.85); 0.8492 (2.19); 0.8412 (2.52); 0.8351 (2.39); 0.8303 (1.73);
0.8204 (1.75); 0.8098 (0.71); 0.7992 (0.56); 0.7923 (0.48); -0.0002 (2.94)

实施例 77, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.5468 (2.45); 7.4370 (1.06); 7.4175 (1.21); 7.2688 (1.40); 7.1709 (1.36);
7.1518 (2.60); 7.1341 (4.11); 6.9999 (1.81); 6.9930 (2.69); 6.9745 (2.11);
3.9151 (14.93); 3.8963 (0.42); 3.3110 (59.42); 2.8225 (0.45); 2.8049 (1.51);

[0444]

2.7871 (1.57); 2.7697 (0.48); 2.6267 (8.33); 2.5224 (0.56); 2.5089 (12.40); 2.5046 (24.85); 2.5001 (33.26); 2.4956 (23.70); 2.4913 (11.32); 1.1424 (16.00); 1.1240 (8.81); 1.1062 (8.51); 0.7960 (14.58); -0.0002 (7.03)

实施例 78, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.3655 (2.61); 7.4121 (1.74); 7.3923 (2.03); 7.2751 (1.62); 7.1675 (1.47); 7.1484 (2.91); 7.1409 (3.90); 7.1291 (1.60); 7.0067 (1.83); 6.9898 (2.62); 6.9713 (2.11); 3.8234 (11.60); 3.3075 (8.40); 2.8241 (0.45); 2.8065 (1.50); 2.7888 (1.53); 2.7713 (0.48); 2.5965 (4.82); 2.5922 (5.20); 2.5525 (0.44); 2.5223 (0.52); 2.5088 (11.70); 2.5044 (23.48); 2.4999 (31.42); 2.4955 (22.17); 2.4911 (10.44); 1.1419 (16.00); 1.1233 (8.87); 1.1055 (8.58); 0.7938 (14.46); -0.0002 (5.13)

实施例 79, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.6631 (3.34); 7.2847 (0.38); 7.2698 (1.72); 7.2287 (1.06); 7.2099 (2.57); 7.1935 (2.18); 7.1752 (2.85); 7.1559 (1.32); 7.1505 (0.41); 7.1440 (0.36); 7.1351 (3.39); 7.0685 (2.36); 7.0505 (1.81); 7.0008 (1.79); 3.9396 (1.24); 3.9282 (16.00); 3.3512 (0.60); 3.3335 (1.15); 3.3137 (15.86); 3.2975 (0.68); 3.0713 (0.65); 3.0529 (0.67); 2.6763 (0.37); 2.5567 (0.38); 2.5522 (0.40); 2.5470 (0.34); 2.5297 (1.46); 2.5163 (23.18); 2.5119 (45.78); 2.5073 (61.56); 2.5028 (42.99); 2.4983 (20.10); 2.4839 (1.19); 2.4741 (0.89); 2.4628 (1.54); 2.4571 (0.73); 2.4524 (0.59); 2.4426 (0.79); 2.3342 (0.41); 1.7803 (0.45); 1.7740 (0.52); 1.7698 (0.49); 1.7626 (0.66); 1.7581 (0.73); 1.7471 (0.82); 1.7328 (1.36); 1.7219 (1.21); 1.7106 (0.47); 1.7015 (1.17); 1.6901 (0.94); 1.6789 (0.61); 1.6673 (0.56); 1.3584 (0.51); 1.3479 (0.78); 1.3329 (0.71); 1.3271 (0.92); 1.3222 (0.93); 1.3015 (0.71); 1.2926 (1.08); 1.2760 (1.37); 1.2602 (1.13); 1.2443 (1.35); 1.2273 (0.71); 1.1913 (9.24); 1.1742 (9.32); 1.1577 (0.56); 1.1096 (0.45); 1.0920 (0.40); 0.9788 (9.43); 0.9734 (10.41); 0.9630 (9.95); 0.9577 (10.05); 0.9504 (1.81); 0.9334 (1.07)

实施例 80, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.5099 (4.19); 7.2768 (2.11); 7.2514 (2.14); 7.2319 (3.50); 7.1907 (2.41); 7.1719 (3.92); 7.1526 (2.38); 7.1425 (4.80); 7.0631 (3.44); 7.0447 (2.65); 7.0196 (0.40); 7.0083 (2.36); 3.8366 (16.00); 3.3286 (0.86); 3.3151 (10.34); 3.2928 (1.76); 3.2750 (0.99); 3.0743 (0.74); 3.0640 (0.99); 3.0467 (1.03);

[0445]

3.0205 (0.41); 2.5298 (0.90); 2.5165 (17.94); 2.5121 (36.38); 2.5076 (49.96); 2.5032 (37.55); 2.4990 (20.84); 2.4891 (3.82); 2.4793 (2.75); 2.4682 (2.89); 2.4552 (1.06); 2.4475 (1.55); 2.3345 (0.38); 1.7930 (0.34); 1.7764 (0.63); 1.7702 (0.74); 1.7596 (0.92); 1.7543 (1.05); 1.7384 (1.78); 1.7333 (1.62); 1.7281 (1.92); 1.7078 (1.74); 1.6966 (1.42); 1.6851 (0.86); 1.6736 (0.79); 1.3479 (0.59); 1.3383 (1.04); 1.3174 (1.34); 1.3127 (1.42); 1.2917 (1.02); 1.2792 (1.45); 1.2610 (1.85); 1.2437 (1.44); 1.2294 (1.82); 1.2117 (1.00); 1.1763 (11.73); 1.1593 (11.94); 1.1448 (1.17); 1.1037 (0.42); 1.0971 (0.54); 1.0864 (0.37); 1.0796 (0.49); 0.9764 (12.64); 0.9733 (15.05); 0.9610 (14.27); 0.9579 (14.84); 0.9346 (1.59); 0.9213 (0.64); 0.9086 (0.50); 0.8918 (0.34)

实施例 81, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.5610 (2.67); 7.4384 (1.07); 7.4188 (1.21); 7.2559 (1.30); 7.1688 (1.35); 7.1497 (2.53); 7.1303 (1.59); 7.1213 (2.94); 6.9876 (3.36); 6.9706 (2.11); 3.9375 (14.92); 3.3072 (3.73); 2.8212 (0.46); 2.8037 (1.51); 2.7860 (1.52); 2.7683 (0.47); 2.6908 (0.51); 2.6513 (4.63); 2.6429 (4.00); 2.6032 (0.46); 2.5219 (0.43); 2.5085 (8.66); 2.5041 (17.33); 2.4996 (23.18); 2.4951 (16.37); 2.4907 (7.69); 1.1438 (16.00); 1.1244 (8.75); 1.1066 (8.46); 0.7978 (14.46); -0.0002 (1.61)

实施例 82, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz

8.0621 (1.73); 8.0359 (1.91); 7.9532 (1.21); 7.5467 (1.94); 7.5234 (2.43); 7.5212 (2.37); 7.3366 (1.74); 7.3104 (2.91); 7.2843 (1.37); 7.2624 (11.27); 7.2577 (4.13); 7.0785 (5.87); 6.8998 (2.45); 6.8980 (2.42); 4.2722 (1.76); 4.2487 (5.73); 4.2252 (5.87); 4.2018 (2.01); 3.9668 (15.13); 3.9521 (16.00); 3.9284 (0.98); 3.4965 (0.64); 3.4741 (0.99); 3.4518 (0.73); 3.1242 (1.40); 3.0969 (1.30); 3.0620 (1.93); 3.0347 (1.60); 2.6729 (2.04); 2.6662 (2.02); 2.6107 (1.57); 2.6040 (1.60); 1.3573 (6.11); 1.3338 (12.95); 1.3103 (6.03); 1.2786 (8.87); 1.2554 (8.81); -0.0002 (9.58); -0.0111 (0.39)

实施例 83, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz

8.0632 (2.26); 8.0367 (2.40); 7.6764 (1.21); 7.5363 (2.14); 7.5339 (2.26); 7.5107 (2.83); 7.5083 (2.75); 7.3302 (2.07); 7.3041 (3.45); 7.2780 (1.64); 7.2613 (16.90); 7.1677 (1.83); 6.9883 (3.70); 6.8089 (1.84); 5.2999 (1.14);

[0446]

4.2666 (2.11); 4.2431 (6.85); 4.2196 (7.03); 4.1961 (2.30); 4.1334 (0.72); 4.1096 (0.77); 3.8670 (11.40); 3.4720 (0.74); 3.4496 (1.11); 3.4273 (0.83); 3.4217 (0.73); 3.1265 (1.68); 3.0991 (1.55); 3.0643 (2.32); 3.0369 (1.89); 2.6667 (2.41); 2.6599 (2.38); 2.6045 (1.85); 2.5976 (1.89); 2.0454 (3.29); 1.5630 (7.96); 1.3554 (7.39); 1.3320 (16.00); 1.3084 (8.41); 1.2771 (12.99); 1.2668 (9.18); 1.2594 (10.32); 1.2542 (14.30); 1.2357 (2.00); 0.9037 (2.99); 0.8819 (10.14); 0.8586 (3.65); 0.0107 (0.44); -0.0002 (14.87); -0.0111 (0.61)

实施例 84, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.0630 (0.73); 8.0367 (0.80); 7.9513 (0.46); 7.5412 (0.71); 7.5174 (0.91); 7.3360 (0.64); 7.3098 (1.07); 7.2838 (0.51); 7.2643 (4.73); 7.2572 (0.81); 7.0772 (1.24); 6.8975 (0.64); 4.1584 (1.93); 4.1339 (4.17); 4.1145 (1.72); 4.1099 (3.83); 4.0861 (1.28); 3.9670 (5.40); 3.9295 (0.63); 3.4732 (0.36); 3.1301 (0.50); 3.1028 (0.46); 3.0679 (0.68); 3.0406 (0.57); 2.6711 (0.71); 2.6644 (0.70); 2.6088 (0.54); 2.6022 (0.55); 2.0461 (16.00); 1.7794 (0.56); 1.7562 (1.16); 1.7320 (1.22); 1.7087 (0.66); 1.5987 (6.46); 1.2835 (4.74); 1.2789 (3.50); 1.2598 (9.08); 1.2360 (4.21); 1.0032 (1.99); 0.9785 (3.96); 0.9537 (1.79); -0.0002 (3.37)

实施例 85, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.8100 (3.39); 7.2606 (1.35); 7.1897 (1.11); 7.1708 (2.87); 7.1516 (2.15); 7.1261 (2.57); 7.0693 (2.55); 7.0669 (3.58); 7.0480 (4.77); 7.0284 (2.05); 6.9921 (1.47); 5.7529 (0.92); 3.9239 (15.81); 3.8959 (0.41); 3.3567 (0.87); 3.3067 (120.79); 2.8279 (0.83); 2.8114 (0.91); 2.8036 (0.98); 2.7872 (0.91); 2.7712 (0.33); 2.5090 (12.87); 2.5045 (27.15); 2.4999 (37.73); 2.4954 (27.20); 2.4908 (13.50); 2.4482 (0.35); 2.4433 (0.34); 2.0719 (0.39); 1.5585 (1.18); 1.5516 (0.48); 1.5411 (1.33); 1.5339 (1.27); 1.5165 (1.25); 1.4992 (0.36); 1.2693 (16.00); 1.1649 (9.98); 1.1483 (9.82); 1.0313 (8.92); 1.0139 (8.51); 0.8933 (13.06); 0.0080 (1.40); -0.0002 (44.59); -0.0085 (1.77)

实施例 86, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

9.3812 (1.17); 7.4186 (0.86); 7.3933 (1.08); 7.3254 (0.81); 7.1882 (0.62); 7.1627 (1.26); 7.1465 (1.92); 7.1371 (0.79); 7.0219 (1.17); 7.0195 (1.20); 6.9970 (0.92); 6.9677 (0.89); 4.0407 (0.77); 4.0170 (0.79); 3.8284 (5.13);

[0447]

3.3245 (16.00); 2.9882 (0.40); 2.9628 (0.48); 2.9350 (0.53); 2.9099 (0.51); 2.5132 (1.20); 2.5072 (2.67); 2.5011 (3.73); 2.4950 (2.75); 2.4890 (1.33); 2.4210 (0.44); 2.3852 (0.50); 2.3675 (0.40); 2.3322 (0.42); 1.9887 (3.52); 1.8506 (0.37); 1.8145 (0.39); 1.5972 (0.33); 1.4361 (0.37); 1.3554 (1.52); 1.3201 (0.32); 1.3084 (0.37); 1.2998 (0.38); 1.2777 (6.81); 1.2402 (0.35); 1.1981 (1.05); 1.1744 (2.01); 1.1507 (1.00); 1.0004 (1.74); 0.9761 (3.61); 0.9514 (1.52); 0.9233 (5.28); -0.0002 (2.16)

实施例 87, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.2803 (0.54); 7.2597 (4.39); 7.0359 (0.40); 3.8384 (1.49); 2.6636 (0.36); 2.6217 (0.38); 1.9106 (0.33); 1.9039 (0.33); 1.5452 (1.23); 1.4589 (0.39); 1.4270 (0.40); 1.4119 (0.73); 1.3807 (0.41); 1.3696 (0.41); 1.2398 (0.97); 1.2174 (1.01); 1.0122 (16.00); 0.9734 (0.34); -0.0002 (3.54)

实施例 88, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.0747 (1.19); 8.0499 (1.27); 7.9488 (0.69); 7.5423 (1.09); 7.5399 (1.13); 7.5167 (1.45); 7.5144 (1.41); 7.3432 (1.09); 7.3169 (1.82); 7.2909 (0.83); 7.2621 (8.90); 7.2517 (1.31); 7.1613 (0.56); 7.0717 (2.23); 6.9832 (1.25); 6.8921 (1.18); 6.8051 (0.56); 5.3002 (0.52); 3.9940 (15.31); 3.9658 (16.00); 3.4991 (0.40); 3.4769 (0.60); 3.4545 (0.43); 3.1111 (0.87); 3.0838 (0.80); 3.0489 (1.18); 3.0217 (1.00); 2.6641 (1.29); 2.6576 (1.26); 2.6019 (0.98); 2.5954 (0.98); 1.5726 (1.66); 1.2746 (5.46); 1.2514 (5.47); -0.0002 (7.36)

实施例 89, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.3275 (1.17); 7.2906 (0.77); 7.1945 (0.49); 7.1760 (1.56); 7.1565 (2.56); 7.1431 (1.23); 7.1276 (0.45); 7.0448 (0.87); 7.0259 (0.72); 7.0213 (0.99); 3.9290 (6.87); 3.3147 (7.01); 2.8685 (0.83); 2.8505 (1.72); 2.8323 (0.91); 2.5164 (7.39); 2.5120 (15.20); 2.5075 (20.61); 2.5030 (14.58); 2.4986 (6.83); 1.8729 (1.20); 1.8548 (2.37); 1.8366 (1.10); 1.3115 (16.00)

实施例 90, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

9.5709 (1.25); 7.4482 (0.62); 7.4222 (0.76); 7.3212 (0.76); 7.1922 (0.64); 7.1667 (1.31); 7.1419 (2.33); 7.0225 (1.28); 6.9998 (0.99); 6.9631 (0.82); 3.9197 (7.35); 3.3237 (16.00); 3.0325 (0.43); 3.0070 (0.52); 2.9791 (0.59); 2.9539 (0.54); 2.5129 (1.36); 2.5070 (2.97); 2.5009 (4.12); 2.4949 (3.03); 2.4889 (1.47); 2.4324 (0.48); 2.3974 (0.54); 2.3793 (0.43); 2.3440 (0.46);

[0448]

1.9887 (0.78); 1.8514 (0.39); 1.8400 (0.32); 1.8153 (0.41); 1.5963 (0.36);
1.5714 (0.33); 1.3553 (1.47); 1.3183 (0.37); 1.3061 (0.38); 1.2787 (7.16);
1.2379 (0.38); 1.1979 (0.32); 1.1743 (0.48); 0.9998 (1.87); 0.9755 (3.82);
0.9509 (1.63); 0.9244 (5.62); -0.0002 (1.49)

实施例 91, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.0580 (2.60); 8.0332 (2.79); 8.0315 (2.78); 7.6744 (1.45); 7.5316 (2.48);
7.5292 (2.63); 7.5060 (3.28); 7.5037 (3.18); 7.3269 (2.42); 7.3007 (3.98);
7.2745 (1.90); 7.2620 (10.55); 7.1684 (2.07); 6.9890 (4.24); 6.8097 (2.10);
4.1571 (4.88); 4.1348 (10.31); 4.1124 (5.11); 3.8651 (13.21); 3.8359 (0.40);
3.8335 (0.40); 3.4705 (0.85); 3.4482 (1.28); 3.4261 (0.94); 3.4203 (0.82);
3.1328 (1.91); 3.1054 (1.77); 3.0705 (2.62); 3.0431 (2.13); 2.6654 (2.72);
2.6585 (2.73); 2.6031 (2.12); 2.5962 (2.16); 2.0448 (0.77); 1.8020 (0.49);
1.7773 (2.09); 1.7545 (4.35); 1.7300 (4.60); 1.7071 (2.36); 1.6831 (0.63);
1.5834 (5.45); 1.3055 (0.43); 1.2772 (12.18); 1.2540 (12.62); 1.2354 (0.76);
1.0024 (7.87); 0.9778 (16.00); 0.9529 (6.99); 0.9035 (0.94); 0.8817 (3.05);
0.8584 (1.12); -0.0002 (8.97); -0.0111 (0.36)

实施例 92, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

11.6172 (0.46); 7.2374 (0.37); 7.2135 (0.57); 7.2027 (0.50); 7.1977 (0.73);
7.1883 (0.73); 7.1591 (0.45); 7.1543 (0.38); 7.0092 (0.35); 3.9123 (2.71);
3.5674 (16.00); 3.3225 (6.78); 2.5125 (0.97); 2.5068 (1.90); 2.5007 (2.59);
2.4947 (1.93); 2.4887 (0.98); 2.0741 (1.28); 1.3871 (2.55); 1.3548 (0.47);
1.0502 (2.72); 1.0330 (1.37); 0.8971 (1.18); 0.8764 (1.22); -0.0002 (0.90)

实施例 93, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

9.5832 (0.40); 7.1334 (0.65); 7.1287 (0.46); 7.0029 (0.40); 5.7575 (16.00);
3.9172 (2.22); 3.3217 (12.91); 2.6137 (0.87); 2.5132 (1.48); 2.5072 (3.26);
2.5011 (4.56); 2.4950 (3.37); 2.4890 (1.63); 1.3886 (0.32); 1.1166 (1.08);
1.0928 (1.08); 0.8453 (0.53); 0.8207 (1.17); 0.7957 (0.46); 0.7659 (0.53);
0.7416 (1.13); 0.7166 (0.44); -0.0002 (3.60)

实施例 94, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

9.5995 (1.17); 7.4193 (0.51); 7.3925 (0.61); 7.2985 (0.61); 7.1509 (0.54);
7.1255 (1.24); 7.1192 (1.56); 7.0998 (0.67); 6.9993 (1.09); 6.9748 (0.79);
6.9398 (0.67); 5.7572 (15.70); 3.9392 (5.98); 3.3225 (16.00); 2.9321 (0.59);

[0449]

2.9079 (0.61); 2.6293 (2.58); 2.5131 (1.53); 2.5071 (3.30); 2.5011 (4.57);
2.4950 (3.33); 2.4890 (1.61); 1.4157 (0.55); 1.4076 (0.73); 1.3899 (0.91);
1.3826 (0.82); 1.3656 (0.89); 1.3432 (0.49); 1.3239 (0.52); 1.2992 (0.57);
1.2771 (0.38); 1.1170 (2.94); 1.0932 (2.90); 0.8475 (1.43); 0.8231 (3.15);
0.7982 (1.25); 0.7688 (1.43); 0.7444 (3.05); 0.7196 (1.21); -0.0002 (3.70)

实施例 95, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

11.4429 (0.44); 7.2948 (0.50); 7.2339 (0.33); 7.2098 (0.64); 7.2002 (0.60);
7.1539 (0.39); 7.1490 (0.35); 3.8261 (1.92); 3.5675 (16.00); 3.3790 (1.55);
2.5129 (0.70); 2.5070 (1.21); 2.5009 (1.60); 2.4949 (1.24); 2.4892 (0.65);
1.3852 (2.30); 1.3553 (0.63); 1.0480 (2.64); 1.0307 (1.47); 0.8960 (1.28);
0.8754 (1.34); -0.0002 (0.57)

实施例 96, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz

8.0247 (0.61); 7.9986 (0.68); 7.9036 (0.86); 7.7434 (1.14); 7.7172 (1.28);
7.6075 (0.32); 7.3047 (1.93); 7.2616 (57.87); 7.2421 (1.66); 7.2352 (2.20);
7.2158 (0.89); 7.2097 (1.17); 7.1248 (3.81); 7.0623 (1.65); 7.0371 (1.25);
7.0166 (0.80); 6.9913 (0.68); 6.9450 (1.91); 6.9108 (0.36); 5.3014 (0.91);
3.9629 (16.00); 3.9454 (2.02); 3.3625 (0.57); 3.3388 (0.89); 3.3138 (0.94);
3.2895 (0.54); 3.2117 (0.33); 3.1888 (0.55); 3.1646 (0.57); 3.1408 (0.37);
2.6452 (0.63); 2.6170 (1.09); 2.6024 (0.75); 2.5888 (0.62); 2.5742 (1.16);
2.5458 (0.58); 2.0683 (0.37); 2.0423 (0.60); 2.0284 (0.65); 2.0246 (0.63);
2.0013 (0.51); 1.9033 (0.38); 1.8768 (0.44); 1.8699 (0.43); 1.8635 (0.34);
1.8428 (0.44); 1.8288 (0.37); 1.8012 (0.36); 1.6746 (1.49); 1.6139 (1.77);
1.4868 (0.38); 1.4131 (0.76); 1.3940 (1.26); 1.3747 (0.80); 1.3701 (0.87);
1.3463 (7.58); 1.3317 (1.38); 1.3226 (9.20); 1.3198 (9.33); 1.3105 (4.43);
1.2965 (7.63); 1.2879 (4.09); 1.2537 (0.55); 1.2091 (3.23); 1.1856 (3.18);
0.0106 (1.22); -0.0002 (37.41); -0.0111 (1.70)

实施例 97, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz

7.9955 (0.41); 7.9705 (0.43); 7.2608 (3.40); 7.1799 (0.66); 7.1721 (0.50);
7.1545 (0.58); 7.1373 (0.75); 6.9927 (0.86); 6.8133 (0.43); 5.2993 (2.04);
3.8516 (2.78); 3.0171 (0.33); 3.0013 (0.33); 2.9891 (0.33); 2.8071 (0.39);
2.1830 (0.42); 2.1546 (0.51); 2.1441 (0.34); 2.1290 (0.32); 2.1158 (0.33);
0.9472 (16.00); 0.0699 (0.39); -0.0002 (2.93)

[0450]

实施例 98, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.3244 (0.57); 7.3039 (0.36); 7.2792 (0.53); 7.2593 (3.15); 7.2005 (0.49);
7.1765 (0.32); 7.0733 (0.56); 3.9285 (2.88); 2.6683 (0.43); 2.6263 (0.46);
2.0439 (1.00); 1.9108 (0.37); 1.9045 (0.37); 1.5519 (1.21); 1.4641 (0.45);
1.4322 (0.45); 1.4187 (0.62); 1.3855 (0.45); 1.3788 (0.41); 1.2824 (0.45);
1.2586 (2.54); 1.2352 (1.89); 1.0141 (16.00); 0.9743 (0.33); 0.8818 (0.61);
-0.0002 (2.21)

实施例 99, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.8791 (1.58); 7.3668 (1.63); 7.3415 (2.80); 7.2924 (1.51); 7.2670 (3.11);
7.2587 (13.50); 7.2540 (2.72); 7.2417 (2.45); 7.2047 (2.91); 7.1802 (1.67);
7.1217 (0.33); 7.0711 (2.99); 7.0514 (0.38); 6.8910 (1.52); 3.9567 (1.32);
3.9268 (15.36); 3.4270 (0.63); 3.4225 (0.64); 3.3687 (0.78); 3.3449 (1.44);
3.3210 (1.48); 3.2966 (0.85); 3.1714 (0.75); 3.1577 (0.99); 3.1332 (1.01);
2.7311 (0.37); 2.6660 (0.34); 2.5831 (1.31); 2.5565 (2.47); 2.5410 (1.62);
2.5299 (1.37); 2.5145 (2.62); 2.4879 (1.24); 1.8344 (0.39); 1.8121 (0.67);
1.8037 (0.80); 1.7898 (1.09); 1.7724 (1.85); 1.7619 (2.49); 1.7356 (1.65);
1.7209 (1.48); 1.7048 (0.79); 1.6895 (0.76); 1.5540 (3.61); 1.4564 (0.58);
1.4229 (1.41); 1.3946 (1.75); 1.3849 (2.07); 1.3587 (2.77); 1.3422 (1.54);
1.3328 (1.40); 1.3155 (2.32); 1.2907 (1.93); 1.2607 (9.29); 1.2380 (8.76);
1.1746 (0.52); 1.1520 (0.40); 0.9969 (13.04); 0.9882 (14.84); 0.9760
(16.00); 0.9679 (13.23); 0.9550 (2.39); 0.9248 (0.52); 0.9171 (0.40); 0.9095
(0.38); 0.9027 (0.39); 0.8903 (0.33); 0.8816 (0.39); 0.8747 (0.53); 0.8541
(0.42); 0.8471 (0.48); 0.8384 (0.33); 0.8314 (0.52); 0.0706 (0.40); 0.0106
(0.34); -0.0002 (9.53); -0.0111 (0.41)

实施例 100, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.1383 (1.05); 7.2971 (0.76); 7.1860 (0.45); 7.1676 (1.57); 7.1627 (1.93);
7.1492 (1.92); 7.1303 (1.40); 7.1163 (1.49); 7.0982 (0.55); 7.0284 (0.84);
3.8398 (4.84); 3.3147 (6.82); 2.8666 (0.85); 2.8485 (1.74); 2.8303 (0.95);
2.5300 (0.60); 2.5252 (0.83); 2.5167 (7.80); 2.5122 (15.86); 2.5077 (21.66);
2.5031 (15.62); 2.4987 (7.84); 1.8777 (1.23); 1.8595 (2.41); 1.8413 (1.16);
1.2998 (16.00)

实施例 101, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

[0451]

9.3786 (0.50); 7.4163 (0.35); 7.3899 (0.42); 7.3199 (0.33); 7.1410 (0.81); 7.1256 (0.52); 7.0000 (0.50); 6.9753 (0.37); 6.9621 (0.38); 5.7577 (1.47); 3.8258 (2.09); 3.3219 (16.00); 2.5894 (0.93); 2.5132 (1.76); 2.5072 (3.82); 2.5011 (5.27); 2.4950 (3.83); 2.4890 (1.82); 1.4042 (0.43); 1.3908 (0.34); 1.3792 (0.45); 1.3667 (0.36); 1.1158 (1.36); 1.0919 (1.36); 0.8441 (0.65); 0.8196 (1.47); 0.7946 (0.58); 0.7653 (0.67); 0.7408 (1.42); 0.7161 (0.57); -0.0002 (4.37)

实施例 102, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

11.6067 (0.41); 7.2360 (0.35); 7.2115 (0.43); 7.1854 (0.55); 7.1665 (0.75); 7.1579 (0.52); 3.9320 (2.28); 3.5675 (16.00); 3.3476 (2.35); 2.5128 (1.56); 2.5069 (3.41); 2.5009 (4.77); 2.4948 (3.64); 2.4890 (1.84); 2.0744 (3.85); 1.3879 (2.20); 1.3548 (0.35); 1.0492 (2.15); 1.0351 (1.28); 0.9046 (1.01); 0.8839 (1.07); -0.0002 (2.75)

实施例 103, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz

7.8782 (2.72); 7.8522 (2.96); 7.6061 (1.60); 7.2602 (26.93); 7.2360 (4.44); 7.2293 (3.17); 7.2100 (2.49); 7.0498 (5.45); 7.0070 (3.59); 7.0049 (3.71); 6.9819 (3.05); 6.9796 (2.99); 6.8704 (2.71); 3.8630 (15.01); 3.3585 (0.70); 3.3483 (0.84); 3.3318 (1.06); 3.3240 (1.08); 3.3079 (0.91); 3.2973 (0.81); 2.2867 (2.09); 2.2585 (2.14); 2.2440 (2.63); 2.2159 (2.35); 1.8680 (1.74); 1.8544 (2.05); 1.8293 (5.51); 1.8166 (7.37); 1.7914 (2.39); 1.7844 (2.22); 1.7781 (4.38); 1.7670 (4.60); 1.7532 (1.93); 1.7354 (4.00); 1.7243 (3.94); 1.7166 (1.79); 1.6840 (1.34); 1.6685 (0.71); 1.5511 (16.00); 1.3040 (14.16); 1.2805 (14.01); 0.0106 (0.58); -0.0002 (18.52); -0.0112 (0.79)

实施例 104, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz

8.9167 (1.71); 7.4121 (1.83); 7.3868 (2.68); 7.3259 (0.40); 7.3055 (1.46); 7.2804 (2.69); 7.2595 (23.77); 7.2123 (2.11); 7.1677 (3.32); 7.1432 (2.45); 7.1034 (0.34); 7.0328 (3.86); 6.8528 (1.93); 5.2982 (3.46); 3.9148 (0.37); 3.8354 (12.46); 3.7781 (0.60); 3.7657 (0.69); 3.7032 (0.32); 3.4044 (0.73); 3.3815 (1.38); 3.3569 (1.46); 3.3350 (0.92); 2.3702 (3.02); 2.3422 (3.05); 2.3269 (3.62); 2.2988 (3.32); 2.0443 (0.53); 1.7611 (2.38); 1.7242 (5.08); 1.7046 (4.73); 1.6880 (5.99); 1.6705 (5.53); 1.6493 (6.07); 1.6270 (3.95); 1.6063 (3.75); 1.5482 (16.00); 1.5317 (2.52); 1.5121 (3.28); 1.4888 (5.29);

[0452]

1.4571 (4.54); 1.4252 (1.87); 1.4139 (1.66); 1.3885 (0.93); 1.3779 (0.75);
1.3643 (0.66); 1.3418 (1.06); 1.3320 (1.07); 1.3029 (1.67); 1.2825 (1.50);
1.2586 (2.28); 1.2351 (9.14); 1.2122 (8.62); 0.0106 (0.48); -0.0002 (15.57);
-0.0111 (0.75)

实施例 105, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.8484 (0.65); 7.7163 (1.13); 7.6900 (1.29); 7.2976 (0.57); 7.2723 (1.27);
7.2602 (10.31); 7.2469 (0.90); 7.1867 (0.76); 7.1367 (1.44); 7.1119 (1.08);
7.0067 (1.55); 6.8267 (0.76); 3.9255 (7.42); 3.0294 (0.59); 3.0042 (0.64);
2.9770 (0.72); 2.9518 (0.72); 2.5060 (0.59); 2.4708 (0.71); 2.4537 (0.56);
2.4181 (0.61); 2.0216 (0.33); 2.0055 (16.00); 1.9848 (0.72); 1.9730 (0.58);
1.9601 (0.54); 1.9487 (0.66); 1.6742 (0.58); 1.6612 (0.65); 1.6492 (0.77);
1.6361 (0.82); 1.6302 (0.90); 1.6174 (0.78); 1.6052 (0.80); 1.5925 (0.67);
1.5805 (0.35); 1.3984 (0.51); 1.3742 (0.63); 1.3619 (0.57); 1.3536 (0.66);
1.3312 (9.40); 1.2940 (0.74); 1.0269 (2.70); 1.0023 (5.15); 0.9869 (8.58);
-0.0002 (8.09); -0.0111 (0.35)

实施例 106, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.9422 (0.75); 7.6378 (0.96); 7.6132 (1.13); 7.2888 (0.57); 7.2600 (16.57);
7.2379 (0.93); 7.1222 (2.47); 7.1041 (1.39); 6.9418 (3.25); 6.7620 (1.64);
3.8305 (6.05); 3.0141 (0.93); 2.9888 (1.05); 2.9616 (1.22); 2.9363 (1.21);
2.4919 (0.58); 2.4575 (0.74); 2.4408 (0.62); 2.4048 (0.62); 2.0069 (3.00);
1.9758 (0.83); 1.9646 (0.70); 1.9512 (0.66); 1.9398 (0.86); 1.9159 (0.36);
1.9042 (0.33); 1.6930 (0.36); 1.6805 (0.40); 1.6686 (0.75); 1.6557 (0.77);
1.6438 (0.87); 1.6307 (0.90); 1.6249 (1.03); 1.6118 (0.88); 1.5996 (0.96);
1.5868 (0.85); 1.5750 (0.42); 1.5627 (0.35); 1.3935 (0.65); 1.3692 (0.74);
1.3567 (0.72); 1.3481 (0.80); 1.3274 (16.00); 1.2884 (0.70); 1.2658 (0.35);
1.0258 (4.80); 1.0012 (9.60); 0.9809 (11.96); 0.0107 (0.36); -0.0002
(12.17); -0.0110 (0.60)

实施例 107, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

9.4460 (4.34); 7.3197 (2.54); 7.3013 (2.41); 7.2769 (3.92); 7.2114 (2.40);
7.1862 (4.23); 7.1606 (2.23); 7.1407 (5.64); 7.1240 (0.35); 7.0653 (3.69);
7.0626 (3.73); 7.0405 (2.75); 6.9618 (2.74); 3.8282 (16.00); 3.7590 (0.52);
3.4172 (0.69); 3.3935 (1.13); 3.3712 (1.18); 3.3474 (0.82); 3.3226 (14.49);

[0453]

2.5128 (2.98); 2.5068 (6.52); 2.5007 (9.03); 2.4947 (6.69); 2.4887 (3.28); 2.2682 (1.49); 2.2393 (1.63); 2.2248 (1.93); 2.1961 (1.60); 2.0278 (0.73); 2.0169 (0.68); 1.6802 (3.24); 1.6448 (3.63); 1.6135 (3.04); 1.5954 (2.41); 1.5699 (1.90); 1.5513 (2.36); 1.5392 (2.06); 1.5002 (2.48); 1.4604 (2.66); 1.4404 (2.81); 1.4177 (2.61); 1.3906 (1.67); 1.3168 (0.84); 1.2785 (1.21); 1.2357 (1.41); 1.1974 (0.88); 1.1650 (12.24); 1.1419 (12.13); 1.1087 (0.83); 1.0845 (0.65); 1.0645 (0.54); 1.0437 (0.49); 0.9539 (0.53); -0.0002 (6.17)

实施例 108, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.8431 (1.66); 7.4748 (2.15); 7.4487 (2.90); 7.3174 (1.43); 7.2921 (2.84); 7.2597 (23.30); 7.2448 (1.94); 7.1760 (3.04); 7.1510 (2.17); 7.0644 (3.15); 6.8844 (1.60); 5.2986 (1.85); 4.1323 (0.78); 4.1085 (0.78); 3.9275 (16.00); 3.8687 (0.44); 3.8538 (0.83); 3.7628 (0.35); 3.7029 (1.96); 3.4240 (0.67); 3.4015 (1.28); 3.3772 (1.37); 3.3541 (0.86); 2.3730 (2.37); 2.3449 (2.37); 2.3296 (2.85); 2.3015 (2.58); 2.0442 (3.54); 1.7272 (3.48); 1.7079 (3.70); 1.6894 (4.47); 1.6807 (5.22); 1.6602 (4.10); 1.6376 (3.73); 1.6170 (2.76); 1.5492 (15.32); 1.5344 (2.10); 1.5173 (2.69); 1.4905 (4.36); 1.4599 (3.56); 1.4518 (3.23); 1.4269 (1.75); 1.4162 (1.54); 1.3443 (0.95); 1.3068 (1.57); 1.2825 (2.64); 1.2585 (7.42); 1.2518 (10.76); 1.2284 (9.58); 1.1873 (0.63); 0.9038 (0.86); 0.8819 (2.65); 0.8587 (1.04); 0.0106 (0.49); -0.0002 (14.36); -0.0111 (0.68)

实施例 109, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

10.0757 (0.49); 7.5374 (0.45); 7.1721 (0.46); 7.1457 (0.34); 7.1117 (0.68); 6.9326 (0.33); 5.7574 (0.38); 3.9143 (2.74); 3.3216 (16.00); 2.5130 (1.49); 2.5071 (3.14); 2.5010 (4.29); 2.4949 (3.11); 2.4890 (1.48); 1.2376 (1.58); 1.2147 (1.54); -0.0002 (2.46)

实施例 110, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

9.6130 (3.57); 7.3149 (1.82); 7.2779 (1.44); 7.2542 (3.08); 7.2152 (2.02); 7.1903 (3.11); 7.1646 (1.55); 7.1356 (4.12); 7.0716 (2.68); 7.0683 (2.71); 7.0470 (2.03); 7.0437 (1.95); 6.9565 (2.18); 5.7578 (0.67); 3.9427 (0.98); 3.9204 (16.00); 3.8981 (0.76); 3.8736 (2.50); 3.8541 (0.68); 3.4370 (0.52); 3.4120 (0.82); 3.3923 (0.88); 3.3682 (0.67); 3.3250 (4.18); 2.5130 (2.20); 2.5070 (4.88); 2.5009 (6.82); 2.4948 (5.05); 2.4889 (2.46); 2.2486 (1.10);

[0454]

2.2195 (1.20); 2.2051 (1.42); 2.1762 (1.19); 2.0608 (0.57); 2.0288 (0.51); 1.6719 (2.39); 1.6599 (2.54); 1.6344 (3.24); 1.6165 (2.47); 1.5901 (1.60); 1.5730 (1.50); 1.5480 (1.48); 1.5142 (1.77); 1.4742 (2.21); 1.4351 (1.77); 1.4118 (1.76); 1.3984 (1.57); 1.3737 (1.18); 1.3193 (0.62); 1.3115 (0.62); 1.2874 (0.93); 1.2315 (1.80); 1.2192 (1.63); 1.1980 (1.35); 1.1794 (9.49); 1.1563 (9.23); 1.1272 (0.65); 1.1170 (0.53); 1.1043 (0.54); -0.0002 (2.07)

实施例 111, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

9.5824 (3.21); 7.3036 (1.71); 7.2841 (2.68); 7.2791 (2.18); 7.2168 (1.81); 7.1978 (3.24); 7.1785 (1.63); 7.1443 (3.72); 7.0661 (2.73); 7.0644 (2.85); 7.0475 (2.22); 7.0458 (2.17); 7.0099 (1.88); 3.9283 (16.00); 3.4401 (0.54); 3.4281 (0.70); 3.4214 (0.83); 3.4097 (0.85); 3.4026 (0.72); 3.3908 (0.58); 3.3150 (12.20); 2.5297 (0.65); 2.5163 (14.74); 2.5119 (29.97); 2.5074 (40.60); 2.5029 (28.59); 2.4984 (13.31); 2.1879 (1.38); 2.1670 (1.54); 2.1562 (1.74); 2.1354 (1.48); 1.8186 (1.84); 1.8032 (2.71); 1.7851 (2.06); 1.7808 (2.12); 1.7654 (2.27); 1.7473 (1.97); 1.7369 (2.16); 1.7302 (2.18); 1.7105 (1.58); 1.6966 (1.33); 1.6863 (1.24); 1.6544 (0.92); 1.6338 (1.83); 1.6221 (1.74); 1.6021 (1.57); 1.5905 (1.53); 1.1848 (9.70); 1.1674 (9.60)

实施例 112, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.8800 (1.17); 7.7697 (1.62); 7.7436 (1.80); 7.3197 (1.67); 7.2605 (27.74); 7.2511 (1.71); 7.2246 (2.65); 7.1985 (1.45); 7.1397 (3.38); 6.9599 (1.74); 6.9246 (2.35); 6.9223 (2.30); 6.9094 (0.32); 6.8995 (2.09); 3.9625 (16.00); 3.3954 (0.47); 3.3715 (0.70); 3.3486 (0.73); 3.3251 (0.51); 2.2736 (1.42); 2.2441 (1.50); 2.2293 (1.75); 2.1999 (1.57); 2.0078 (5.36); 1.7207 (0.62); 1.7058 (0.61); 1.6956 (1.88); 1.6812 (1.95); 1.6706 (1.97); 1.6568 (2.21); 1.6457 (0.91); 1.6330 (2.89); 1.6146 (3.18); 1.5889 (2.94); 1.5706 (1.69); 1.5648 (0.90); 1.5453 (7.37); 1.5365 (1.74); 1.5117 (1.62); 1.4905 (0.96); 1.4660 (0.77); 1.3118 (10.14); 1.2886 (9.95); 1.2008 (0.79); 0.9068 (0.43); 0.8734 (4.53); 0.8487 (9.75); 0.8238 (4.06); 0.7374 (4.48); 0.7127 (9.73); 0.6879 (4.02); 0.0106 (0.70); -0.0002 (22.00); -0.0111 (0.86)

实施例 113, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.7732 (2.51); 7.7471 (2.75); 7.5862 (1.69); 7.2614 (3.89); 7.2584 (3.18); 7.2370 (2.07); 7.2112 (4.02); 7.1853 (2.27); 7.1688 (0.41); 7.0961 (0.43);

[0455]

7.0788 (5.86); 6.9118 (3.67); 6.9092 (3.88); 6.8994 (3.22); 6.8867 (3.31); 6.8841 (3.19); 3.8506 (16.00); 3.3748 (0.68); 3.3516 (1.08); 3.3267 (1.14); 3.3039 (0.79); 2.2709 (2.22); 2.2414 (2.30); 2.2267 (2.76); 2.1972 (2.42); 1.7389 (0.49); 1.7179 (0.99); 1.7142 (0.84); 1.7018 (1.04); 1.6928 (2.96); 1.6772 (3.19); 1.6677 (3.86); 1.6527 (3.61); 1.6481 (2.18); 1.6435 (1.61); 1.6313 (3.96); 1.6233 (2.04); 1.6132 (2.98); 1.6022 (2.68); 1.5872 (2.70); 1.5773 (2.66); 1.5689 (2.66); 1.5521 (1.38); 1.5265 (2.27); 1.5019 (2.59); 1.4808 (1.57); 1.4562 (1.53); 1.4503 (4.72); 1.4321 (0.53); 1.3460 (0.49); 1.3143 (14.65); 1.2912 (14.48); 1.2502 (0.64); 1.2259 (1.06); 1.2022 (0.71); 1.1899 (0.47); 1.0321 (0.82); 1.0214 (0.44); 1.0081 (0.83); 0.9969 (0.84); 0.9722 (0.36); 0.9627 (0.48); 0.9588 (0.40); 0.9315 (0.87); 0.9061 (0.65); 0.8695 (7.03); 0.8448 (15.29); 0.8199 (6.31); 0.7246 (6.90); 0.7000 (15.04); 0.6752 (6.23); 0.5327 (0.33); -0.0002 (1.39)

实施例 114, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.9095 (0.89); 7.7596 (1.32); 7.7327 (1.43); 7.2857 (1.37); 7.2726 (0.34); 7.2711 (0.39); 7.2696 (0.55); 7.2605 (49.21); 7.2529 (2.02); 7.2513 (1.99); 7.2500 (1.94); 7.2237 (2.23); 7.1981 (1.15); 7.1055 (2.58); 6.9256 (3.25); 6.9095 (0.45); 6.9003 (1.72); 6.8978 (1.66); 3.9984 (12.69); 3.4113 (0.40); 3.3870 (0.58); 3.3630 (0.61); 3.3397 (0.42); 2.2699 (1.22); 2.2404 (1.26); 2.2258 (1.50); 2.1963 (1.28); 2.0084 (5.37); 1.7212 (0.55); 1.6961 (1.56); 1.6796 (1.64); 1.6711 (1.69); 1.6551 (1.75); 1.6463 (0.76); 1.6297 (2.05); 1.6116 (2.14); 1.5893 (1.57); 1.5854 (1.67); 1.5671 (1.61); 1.5411 (16.00); 1.5130 (1.46); 1.4919 (0.81); 1.4674 (0.66); 1.3095 (8.25); 1.2864 (8.15); 0.8724 (3.78); 0.8477 (8.22); 0.8228 (3.40); 0.7420 (3.72); 0.7174 (8.21); 0.6926 (3.36); 0.0107 (1.23); -0.0002 (39.47); -0.0093 (1.16); -0.0111 (1.57)

实施例 115, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 400,13 MHz

7.8823 (1.01); 7.8089 (0.54); 7.7873 (1.54); 7.7666 (1.22); 7.2652 (0.95); 7.2590 (15.04); 7.2347 (2.48); 7.2152 (1.33); 7.1303 (1.29); 7.1262 (2.42); 6.9954 (0.72); 6.9913 (1.26); 6.9621 (1.63); 6.9604 (1.72); 6.9503 (0.88); 6.9433 (1.48); 6.9416 (1.49); 6.9332 (0.70); 6.9315 (0.68); 3.9590 (16.00); 3.4048 (0.32); 3.3927 (0.42); 3.3875 (0.47); 3.3837 (0.48); 3.3754 (0.55);

[0456]

3.3713 (0.54); 3.3657 (0.56); 3.3544 (0.52); 3.3480 (0.33); 2.3708 (0.49);
2.3491 (0.50); 2.3382 (0.56); 2.3165 (0.50); 2.1314 (1.05); 2.1096 (1.08);
2.0987 (1.32); 2.0770 (1.20); 2.0031 (1.61); 1.7695 (1.25); 1.7575 (1.23);
1.7367 (1.06); 1.7248 (1.07); 1.7111 (0.33); 1.6954 (0.43); 1.6925 (0.45);
1.6767 (1.33); 1.6579 (1.53); 1.6548 (1.45); 1.6362 (1.42); 1.6204 (0.59);
1.6179 (0.55); 1.6065 (0.58); 1.6019 (0.44); 1.5878 (0.54); 1.5494 (1.22);
1.5422 (9.06); 1.5312 (0.62); 1.5164 (0.79); 1.5054 (0.58); 1.3127 (9.94);
1.3050 (7.02); 1.2952 (9.72); 1.1936 (13.59); 0.9284 (3.50); 0.9099 (7.52);
0.8912 (3.16); 0.8166 (1.60); 0.7981 (3.46); 0.7794 (1.46); -0.0002 (3.55)

实施例 116, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 400,13 MHz

7.8120 (0.73); 7.7932 (2.02); 7.7736 (1.54); 7.7558 (0.40); 7.7354 (0.32);
7.6661 (0.39); 7.6116 (0.37); 7.6082 (0.36); 7.5857 (1.13); 7.2729 (0.33);
7.2698 (0.37); 7.2590 (21.82); 7.2469 (1.58); 7.2274 (2.96); 7.2080 (1.69);
7.2023 (0.58); 7.1945 (2.28); 7.0673 (0.35); 7.0599 (4.65); 6.9516 (1.94);
6.9499 (2.03); 6.9425 (1.19); 6.9408 (1.24); 6.9327 (1.84); 6.9310 (1.87);
6.9250 (2.97); 3.8616 (12.69); 3.8271 (1.05); 3.3825 (0.38); 3.3698 (0.49);
3.3648 (0.57); 3.3612 (0.56); 3.3526 (0.66); 3.3489 (0.66); 3.3432 (0.69);
3.3318 (0.64); 3.3255 (0.43); 3.3151 (0.34); 2.7991 (1.48); 2.7971 (1.52);
2.3698 (0.71); 2.3481 (0.72); 2.3371 (0.81); 2.3155 (0.73); 2.1301 (1.24);
2.1084 (1.27); 2.0975 (1.55); 2.0758 (1.42); 2.0031 (0.80); 1.7648 (1.44);
1.7525 (1.42); 1.7321 (1.26); 1.7198 (1.23); 1.7100 (0.42); 1.6943 (0.52);
1.6914 (0.55); 1.6756 (1.53); 1.6568 (1.65); 1.6523 (1.57); 1.6337 (1.62);
1.6151 (0.78); 1.6111 (0.51); 1.5992 (0.54); 1.5955 (0.83); 1.5769 (0.80);
1.5586 (0.54); 1.5427 (4.97); 1.5359 (1.52); 1.5224 (0.90); 1.5147 (0.90);
1.5067 (0.55); 1.5032 (1.09); 1.4883 (0.39); 1.3156 (11.38); 1.3023 (10.73);
1.2982 (12.08); 1.1848 (16.00); 0.9258 (4.16); 0.9072 (8.90); 0.8885 (3.76);
0.8078 (2.31); 0.7892 (4.97); 0.7706 (2.10); -0.0002 (5.29)

实施例 117, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 400,13 MHz

7.9116 (1.03); 7.7976 (0.51); 7.7763 (1.58); 7.7557 (1.24); 7.2588 (8.83);
7.2537 (1.47); 7.2338 (2.99); 7.2282 (1.35); 7.2146 (1.41); 7.0977 (1.16);
7.0930 (2.31); 6.9626 (2.31); 6.9607 (2.18); 6.9532 (0.92); 6.9514 (0.89);
6.9437 (1.58); 6.9420 (1.53); 6.9342 (0.70); 6.9326 (0.67); 3.9938 (16.00);

[0457]

3.4212 (0.34); 3.4092 (0.43); 3.4040 (0.49); 3.4002 (0.49); 3.3917 (0.56);
3.3879 (0.56); 3.3824 (0.58); 3.3709 (0.51); 3.3649 (0.34); 2.3680 (0.47);
2.3463 (0.48); 2.3354 (0.54); 2.3137 (0.49); 2.1290 (1.08); 2.1073 (1.12);
2.0964 (1.36); 2.0747 (1.25); 2.0018 (0.63); 1.7647 (1.28); 1.7526 (1.27);
1.7319 (1.13); 1.7200 (1.09); 1.7113 (0.37); 1.6955 (0.46); 1.6927 (0.47);
1.6769 (1.36); 1.6580 (1.57); 1.6545 (1.45); 1.6359 (1.44); 1.6200 (0.61);
1.6178 (0.58); 1.6063 (0.59); 1.6017 (0.47); 1.5877 (0.57); 1.5686 (0.50);
1.5571 (0.80); 1.5498 (0.90); 1.5456 (0.86); 1.5341 (0.82); 1.5313 (0.68);
1.5129 (0.76); 1.5016 (0.58); 1.3104 (9.64); 1.3037 (6.84); 1.2929 (9.35);
1.1942 (13.94); 0.9273 (3.61); 0.9088 (7.72); 0.8901 (3.25); 0.8201 (1.54);
0.8015 (3.31); 0.7829 (1.40); -0.0002 (2.11)

[0458] 中间体的NMR峰列表

[0459]

实施例 III-a-1, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

6.9065 (2.54); 6.8872 (5.52); 6.8711 (2.49); 6.8680 (3.34); 6.8523 (1.23);
6.5152 (4.77); 6.4954 (5.51); 6.4735 (1.54); 6.3631 (4.48); 6.3444 (4.16);
6.2095 (1.53); 6.1910 (1.46); 4.9616 (4.88); 4.0444 (0.76); 4.0266 (0.76);
3.3924 (0.98); 3.3814 (1.25); 3.3724 (1.51); 3.3605 (1.94); 3.3549 (2.29);
3.3450 (1.91); 3.3278 (0.54); 3.2711 (0.61); 3.2535 (0.88); 3.2358 (0.63);
2.8049 (2.55); 2.7841 (2.58); 2.7708 (2.91); 2.7500 (2.56); 2.5516 (0.77);
2.5319 (2.93); 2.5184 (22.10); 2.5143 (43.22); 2.5099 (58.32); 2.5054
(42.72); 2.5012 (21.46); 2.4896 (2.39); 2.4843 (2.29); 2.4799 (1.80);
2.3368 (0.41); 2.0947 (1.79); 2.0750 (1.98); 2.0432 (1.56); 2.0100 (1.42);
1.9974 (3.38); 1.9743 (0.44); 1.9679 (1.64); 1.9487 (11.15); 1.9441
(10.32); 1.9248 (1.47); 1.9184 (0.48); 1.7721 (1.97); 1.7523 (1.83); 1.7378
(2.83); 1.7269 (2.80); 1.7036 (2.63); 1.6928 (2.62); 1.2444 (0.63); 1.2185
(15.95); 1.2016 (16.00); 1.1817 (2.26); 1.1753 (0.70); 1.1719 (0.50);
1.1639 (1.35); 1.1553 (4.73); 1.1383 (4.61)

实施例 III-a-2, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz

7.7310 (0.33); 7.4662 (0.36); 7.4555 (0.40); 7.4322 (0.46); 7.4112 (0.42);
7.3755 (0.53); 7.3524 (0.69); 7.3353 (0.51); 7.3107 (1.03); 7.2840 (0.71);
7.2779 (0.72); 7.2601 (16.58); 7.2273 (0.61); 7.2183 (0.61); 7.2010 (0.62);

[0460]

7.1526 (0.68); 7.1230 (0.88); 7.1052 (1.14); 7.0840 (1.23); 7.0751 (1.21); 7.0470 (1.29); 7.0189 (1.77); 6.9277 (0.88); 6.9090 (0.81); 6.6740 (0.33); 6.1707 (1.23); 6.1465 (1.21); 6.1202 (1.04); 4.1574 (1.07); 4.1336 (3.32); 4.1098 (3.41); 4.0860 (1.19); 3.0493 (0.42); 3.0225 (0.70); 2.9972 (0.78); 2.9699 (0.82); 2.9427 (0.61); 2.8503 (0.39); 2.8234 (0.45); 2.7972 (0.41); 2.6471 (0.53); 2.6172 (0.58); 2.5968 (0.53); 2.5625 (0.71); 2.5289 (0.49); 2.5070 (0.42); 2.4767 (0.37); 2.1916 (0.38); 2.1632 (0.52); 2.1288 (0.69); 2.1060 (0.36); 2.0466 (16.00); 1.7468 (1.83); 1.7161 (0.55); 1.6435 (0.57); 1.6213 (0.70); 1.5979 (1.77); 1.4294 (0.32); 1.3902 (0.35); 1.3450 (0.63); 1.3299 (0.72); 1.3063 (1.38); 1.2828 (6.29); 1.2663 (8.30); 1.2591 (14.48); 1.2352 (4.94); 1.1469 (0.92); 1.1274 (0.45); 1.0867 (0.33); 1.0522 (0.75); 1.0458 (0.73); 1.0292 (0.81); 1.0085 (1.22); 0.9866 (2.97); 0.9715 (1.55); 0.9348 (3.69); 0.9132 (6.20); 0.9040 (4.77); 0.8916 (4.88); 0.8819 (10.14); 0.8587 (3.66); 0.7991 (0.45); 0.7764 (0.39); 0.0105 (0.38); -0.0002 (9.47); -0.0112 (0.38)

实施例 III-a-3, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

6.8729 (1.04); 6.8474 (2.25); 6.8220 (1.34); 6.3715 (6.13); 6.3460 (5.20); 5.7803 (3.48); 4.7637 (1.81); 3.3479 (9.56); 3.3243 (0.43); 2.8269 (0.87); 2.8011 (0.98); 2.7748 (1.11); 2.7494 (1.13); 2.5368 (1.25); 2.5308 (2.70); 2.5247 (3.75); 2.5186 (2.75); 2.5126 (1.32); 2.2829 (0.91); 2.2493 (1.00); 2.2310 (0.77); 2.1974 (0.86); 1.8311 (0.38); 1.8093 (0.57); 1.8007 (0.62); 1.7877 (0.50); 1.7789 (0.85); 1.7574 (0.67); 1.7007 (0.83); 1.6751 (0.96); 1.6677 (1.11); 1.6418 (1.01); 1.6111 (0.46); 1.3238 (16.00); 1.2419 (0.47); 1.2380 (0.45); 1.2194 (0.34); 1.1554 (0.97); 1.0770 (7.41); 1.0556 (7.29); 1.0397 (0.53); 1.0340 (0.58); 0.9925 (13.47); 0.9811 (8.40); 0.9594 (7.48); 0.8948 (1.07)

实施例 III-a-4, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

7.6383 (0.34); 7.6046 (0.36); 7.5053 (0.51); 7.4786 (0.66); 7.4485 (0.63); 7.4243 (0.61); 7.3994 (0.46); 7.3696 (0.46); 7.3568 (0.43); 7.3342 (0.33); 7.1796 (0.46); 7.1557 (0.67); 7.1331 (0.68); 7.0876 (0.67); 7.0512 (1.51); 6.9963 (0.66); 6.9839 (0.39); 6.9288 (2.56); 6.8119 (3.68); 6.7867 (7.33); 6.7611 (4.09); 6.3432 (8.05); 6.3172 (7.18); 5.9182 (7.46); 5.8935 (7.01);

[0461]

5.7574 (2.74); 4.9347 (0.41); 4.7832 (12.43); 4.0406 (0.42); 4.0166 (0.40); 3.5673 (14.34); 3.3933 (0.40); 3.3264 (58.01); 3.2602 (0.33); 3.0629 (0.36); 3.0575 (0.38); 2.9211 (0.37); 2.8961 (0.53); 2.8736 (0.66); 2.8520 (0.51); 2.7376 (6.57); 2.7131 (10.92); 2.6874 (7.68); 2.5069 (12.95); 2.5010 (16.77); 2.4950 (12.55); 2.4516 (0.52); 2.3882 (0.48); 2.3650 (0.66); 2.3426 (0.55); 2.3237 (0.36); 2.0525 (8.52); 2.0267 (11.74); 2.0144 (2.40); 2.0023 (7.64); 1.9886 (2.74); 1.9351 (0.53); 1.7820 (0.85); 1.7354 (1.09); 1.6839 (1.14); 1.6337 (1.44); 1.6018 (1.28); 1.5336 (1.27); 1.3248 (0.58); 1.2929 (0.89); 1.2548 (6.90); 1.2317 (7.91); 1.2013 (3.27); 1.1889 (2.87); 1.1737 (5.08); 1.1501 (5.19); 1.0325 (3.67); 1.0093 (3.71); 0.9747 (0.87); 0.9506 (0.89); 0.9028 (3.51); 0.8805 (3.35); 0.8544 (4.07); 0.8490 (3.74); 0.8375 (10.63); 0.8308 (14.79); 0.8201 (8.18); 0.8113 (4.34); 0.7749 (3.94); 0.7661 (8.73); 0.7558 (16.00); 0.7485 (11.12); 0.7372 (4.21); 0.7319 (4.59); -0.0002 (2.58)

实施例 III-a-5, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 399,95 MHz

6.8259 (2.74); 6.8050 (3.02); 6.4216 (4.06); 6.4006 (3.68); 4.9264 (4.03); 3.3243 (20.22); 3.1724 (0.53); 3.1659 (0.68); 3.1549 (0.62); 3.1490 (1.00); 3.1430 (0.63); 3.1322 (0.71); 3.1257 (0.54); 2.5235 (0.61); 2.5103 (10.68); 2.5059 (20.85); 2.5014 (27.01); 2.4969 (19.55); 2.4926 (9.47); 2.1689 (1.24); 2.1461 (1.28); 2.1364 (1.48); 2.1137 (1.41); 1.6020 (1.75); 1.5950 (1.71); 1.5694 (1.56); 1.5624 (1.56); 1.3807 (15.36); 1.3463 (16.00); 1.2491 (0.63); 1.2241 (1.46); 1.2176 (0.98); 1.2002 (0.95); 1.1860 (9.39); 1.1686 (9.13); 1.1398 (1.39); -0.0002 (1.71)

实施例 III-a-6, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz

7.1812 (0.92); 7.1558 (1.98); 7.1303 (1.17); 6.7594 (2.02); 6.7347 (1.81); 6.6222 (2.17); 6.6195 (2.05); 6.5962 (2.01); 6.5935 (1.88); 4.2693 (0.32); 4.2455 (0.33); 3.6531 (1.30); 2.9369 (0.93); 2.9121 (1.07); 2.8877 (1.22); 2.8630 (1.35); 2.4757 (0.90); 2.4433 (1.26); 2.4268 (0.66); 2.3942 (1.16); 2.3222 (0.84); 2.2989 (1.11); 2.2898 (0.59); 2.2748 (0.83); 2.2666 (0.78); 2.2425 (0.55); 2.1728 (1.50); 1.4192 (0.79); 1.4150 (1.00); 1.3935 (16.00); 1.3673 (0.63); 1.2238 (9.24); 1.2008 (9.27); 1.1837 (0.32); 1.0935 (15.71); 1.0585 (0.38); 1.0366 (0.83); 1.0135 (0.38)

[0462]

实施例 III-a-8, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 399,95 MHz

6.4880 (2.36); 6.4677 (2.97); 6.3637 (0.35); 6.3215 (3.72); 6.3012 (2.96); 4.5228 (4.43); 3.3225 (7.24); 3.1129 (0.51); 3.1052 (0.61); 3.0953 (0.61); 3.0894 (0.79); 3.0828 (0.61); 3.0731 (0.63); 3.0655 (0.53); 2.5227 (0.36); 2.5093 (6.62); 2.5050 (12.85); 2.5005 (16.58); 2.4959 (11.89); 2.4915 (5.71); 2.1316 (1.28); 2.1093 (1.33); 2.0997 (1.53); 2.0774 (1.38); 1.9494 (0.66); 1.9420 (0.70); 1.9359 (0.46); 1.9285 (1.32); 1.9211 (0.46); 1.9150 (0.73); 1.9076 (0.70); 1.8941 (0.34); 1.5662 (1.75); 1.5583 (1.72); 1.5344 (1.74); 1.5263 (1.70); 1.4313 (15.65); 1.3971 (0.88); 1.3758 (16.00); 1.3355 (0.64); 1.2487 (0.74); 1.2242 (1.51); 1.2179 (1.09); 1.1970 (9.42); 1.1796 (9.18); 1.1398 (1.42); 0.7840 (2.20); 0.7785 (2.49); 0.7630 (2.20); 0.7575 (2.46); 0.5905 (0.54); 0.5848 (0.56); 0.5770 (0.59); 0.5709 (1.04); 0.5671 (0.76); 0.5624 (0.72); 0.5581 (0.94); 0.5534 (0.71); 0.5489 (0.64); 0.5455 (0.54); 0.4963 (0.73); 0.4905 (0.73); 0.4876 (0.76); 0.4851 (0.83); 0.4745 (1.02); 0.4674 (0.53); 0.4605 (0.54); 0.4539 (0.46); 0.0079 (0.72); -0.0002 (18.14); -0.0085 (0.66)

实施例 III-a-9, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 399,95 MHz

6.6056 (1.89); 6.5859 (2.15); 6.3218 (3.38); 6.3022 (2.95); 4.4928 (3.78); 3.3225 (14.88); 3.1135 (0.46); 3.1057 (0.54); 3.0962 (0.53); 3.0896 (0.68); 3.0835 (0.54); 3.0739 (0.56); 3.0661 (0.48); 2.5229 (0.41); 2.5181 (0.69); 2.5096 (7.49); 2.5052 (14.84); 2.5006 (19.37); 2.4960 (13.78); 2.4914 (6.47); 2.1759 (14.64); 2.1084 (1.26); 2.0861 (1.29); 2.0764 (1.47); 2.0541 (1.34); 1.5434 (1.81); 1.5353 (1.79); 1.5114 (1.63); 1.5034 (1.63); 1.3347 (0.37); 1.3197 (15.39); 1.2533 (16.00); 1.1907 (9.79); 1.1733 (9.62); 0.0080 (0.87); -0.0002 (22.41); -0.0085 (0.70)

实施例 III-a-10, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 399,95 MHz

7.3910 (2.74); 7.3712 (2.80); 7.2668 (1.02); 7.2462 (1.05); 6.2601 (3.18); 6.2403 (3.33); 6.2235 (1.20); 4.8152 (0.69); 3.3518 (0.37); 3.2653 (0.61); 3.2581 (0.75); 3.2421 (1.01); 3.2261 (0.78); 3.2190 (0.68); 3.0866 (0.40); 2.5058 (28.67); 2.5014 (37.78); 2.4971 (29.81); 2.1547 (0.49); 2.1401 (1.34); 2.1325 (0.69); 2.1179 (1.53); 2.1079 (1.59); 2.1001 (0.70); 2.0856 (1.38); 1.6251 (0.59); 1.6185 (0.68); 1.5925 (0.54); 1.5861 (0.60); 1.5701

[0463]

(1.61); 1.5624 (1.65); 1.5451 (0.34); 1.5379 (1.46); 1.5302 (1.50); 1.3830 (0.36); 1.3595 (5.71); 1.3295 (6.00); 1.2582 (0.33); 1.2415 (2.07); 1.2332 (2.33); 1.2254 (14.51); 1.2162 (3.01); 1.2109 (9.08); 1.1935 (8.52); 1.1739 (3.65); 1.1544 (16.00); 0.0081 (0.78); -0.0002 (14.64)

实施例 III-a-11, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.3053 (1.37); 7.0792 (1.79); 7.0538 (3.87); 7.0284 (2.37); 6.8044 (3.54); 6.7797 (3.01); 6.7414 (0.46); 6.7170 (0.39); 6.6069 (3.62); 6.5809 (3.30); 6.5466 (0.46); 3.5737 (3.85); 3.0045 (1.34); 2.9918 (1.57); 2.9787 (1.98); 2.9667 (1.69); 2.9539 (0.41); 2.8288 (1.19); 2.8024 (2.53); 2.7900 (0.52); 2.7825 (1.25); 2.7645 (3.37); 2.7450 (2.12); 2.7187 (1.35); 2.7046 (0.32); 2.6932 (0.64); 2.6380 (0.43); 2.5046 (0.57); 2.4877 (0.70); 2.4623 (1.87); 2.4444 (1.88); 2.4231 (0.53); 2.4180 (0.62); 2.4040 (0.36); 2.2101 (0.40); 2.1974 (0.45); 2.1873 (1.02); 2.1746 (1.06); 2.1645 (1.45); 2.1518 (1.44); 2.1418 (1.20); 2.1291 (1.12); 2.1191 (0.57); 2.1064 (0.50); 1.2948 (0.39); 1.2728 (12.26); 1.2663 (3.79); 1.2501 (13.79); 1.2293 (2.54); 1.2138 (0.45); 1.2073 (0.35); 1.1471 (15.90); 1.1239 (15.33); 1.0821 (0.47); 1.0590 (0.44); 0.7513 (16.00); 0.7290 (15.71); 0.0881 (0.91)

实施例 III-a-17, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

6.8285 (2.15); 6.8095 (4.24); 6.7906 (2.57); 6.3782 (4.00); 6.3605 (7.70); 6.3414 (4.16); 4.7221 (6.86); 3.3391 (68.02); 2.8286 (0.77); 2.8108 (2.54); 2.7931 (2.65); 2.7754 (0.91); 2.5902 (3.08); 2.5521 (5.04); 2.5302 (0.91); 2.5167 (18.78); 2.5122 (39.68); 2.5077 (54.98); 2.5032 (40.58); 2.4988 (20.62); 2.4281 (4.76); 2.3900 (3.04); 2.3346 (0.37); 1.6685 (1.97); 1.6584 (4.64); 1.6491 (7.89); 1.6405 (5.83); 1.6311 (5.00); 1.6159 (1.10); 1.5619 (0.82); 1.5431 (1.21); 1.5318 (1.40); 1.5186 (3.01); 1.5114 (3.52); 1.5019 (4.85); 1.4886 (2.44); 1.3067 (0.76); 1.3014 (0.73); 1.2940 (1.32); 1.2775 (1.07); 1.2630 (1.41); 1.2531 (0.77); 1.0593 (15.98); 1.0415 (16.00)

实施例 III-a-18, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.2569 (11.63); 7.0258 (1.72); 7.0004 (3.85); 6.9751 (2.29); 6.6525 (3.09); 6.6276 (2.85); 6.5045 (3.45); 6.4786 (3.18); 3.5895 (2.72); 3.2067 (0.68); 3.1840 (1.10); 3.1579 (1.17); 3.1353 (0.80); 3.0041 (0.65); 2.9836 (1.19); 2.9740 (0.90); 2.9633 (0.90); 2.9535 (1.35); 2.9332 (0.82); 2.3958 (1.18);

[0464]

2.3662 (2.00); 2.3519 (1.38); 2.3363 (1.09); 2.3222 (2.25); 2.2924 (1.17); 2.1442 (0.35); 2.1216 (0.93); 2.0991 (1.39); 2.0799 (1.50); 2.0576 (1.05); 2.0456 (1.20); 2.0355 (0.56); 1.5590 (7.77); 1.5161 (1.25); 1.4959 (1.68); 1.4740 (1.66); 1.4521 (1.54); 1.4312 (1.08); 1.3485 (15.84); 1.3254 (16.00); 1.3075 (1.72); 1.2666 (9.11); 1.2360 (1.27); 1.2186 (0.99); 1.2120 (1.59); 1.1954 (0.69); 1.1888 (1.38); 1.0343 (14.01); 1.0186 (2.49); 1.0116 (13.64); 0.9968 (1.53); 0.9037 (3.19); 0.8820 (9.76); 0.8587 (3.85); 0.8339 (14.37); 0.8114 (13.99); 0.7313 (1.21); 0.7085 (1.17); -0.0002 (7.18); -0.0109 (0.35)

实施例 III-a-19, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.2569 (11.63); 7.0258 (1.72); 7.0004 (3.85); 6.9751 (2.29); 6.6525 (3.09); 6.6276 (2.85); 6.5045 (3.45); 6.4786 (3.18); 3.5895 (2.72); 3.2067 (0.68); 3.1840 (1.10); 3.1579 (1.17); 3.1353 (0.80); 3.0041 (0.65); 2.9836 (1.19); 2.9740 (0.90); 2.9633 (0.90); 2.9535 (1.35); 2.9332 (0.82); 2.3958 (1.18); 2.3662 (2.00); 2.3519 (1.38); 2.3363 (1.09); 2.3222 (2.25); 2.2924 (1.17); 2.1442 (0.35); 2.1216 (0.93); 2.0991 (1.39); 2.0799 (1.50); 2.0576 (1.05); 2.0456 (1.20); 2.0355 (0.56); 1.5590 (7.77); 1.5161 (1.25); 1.4959 (1.68); 1.4740 (1.66); 1.4521 (1.54); 1.4312 (1.08); 1.3485 (15.84); 1.3254 (16.00); 1.3075 (1.72); 1.2666 (9.11); 1.2360 (1.27); 1.2186 (0.99); 1.2120 (1.59); 1.1954 (0.69); 1.1888 (1.38); 1.0343 (14.01); 1.0186 (2.49); 1.0116 (13.64); 0.9968 (1.53); 0.9037 (3.19); 0.8820 (9.76); 0.8587 (3.85); 0.8339 (14.37); 0.8114 (13.99); 0.7313 (1.21); 0.7085 (1.17); -0.0002 (7.18); -0.0109 (0.35)

实施例 III-a-20, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 399,95 MHz

6.9856 (2.73); 6.9647 (2.91); 6.3668 (3.78); 6.3458 (3.55); 4.9595 (4.61); 3.3211 (10.45); 3.1607 (0.54); 3.1548 (0.70); 3.1430 (0.68); 3.1377 (1.06); 3.1324 (0.68); 3.1206 (0.74); 3.1145 (0.57); 2.5057 (29.97); 2.5013 (38.25); 2.4968 (28.72); 2.1675 (1.21); 2.1446 (1.26); 2.1350 (1.46); 2.1121 (1.30); 1.6130 (1.72); 1.6062 (1.70); 1.5804 (1.53); 1.5737 (1.54); 1.3972 (0.50); 1.3820 (15.39); 1.3509 (16.00); 1.1827 (9.02); 1.1653 (8.88); 0.0079 (0.95); -0.0002 (20.56); -0.0084 (1.04)

实施例 III-a-21, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

[0465]

7.4837 (0.59); 7.4731 (0.56); 7.4642 (0.52); 7.4174 (0.49); 7.3891 (4.11); 7.3840 (2.23); 7.3731 (3.04); 7.3618 (10.60); 7.3510 (3.28); 7.3408 (12.08); 7.3045 (17.43); 7.2906 (21.25); 7.2670 (13.38); 7.2489 (3.27); 7.2441 (3.38); 7.2023 (0.69); 7.1848 (1.29); 7.1752 (0.78); 7.1594 (0.48); 7.1462 (0.41); 7.1220 (0.60); 7.0901 (0.48); 7.0570 (3.46); 7.0316 (7.28); 7.0063 (4.45); 6.9699 (0.35); 6.7074 (6.06); 6.6830 (5.33); 6.5559 (6.72); 6.5299 (6.12); 4.0220 (0.34); 3.8835 (0.40); 3.6116 (1.03); 3.5696 (6.54); 3.0884 (1.57); 3.0748 (1.91); 3.0670 (1.99); 3.0383 (2.17); 3.0188 (3.32); 2.9860 (0.48); 2.9605 (0.50); 2.9480 (0.45); 2.9283 (0.75); 2.9053 (2.39); 2.8915 (2.45); 2.8694 (11.50); 2.8609 (16.00); 2.8471 (5.96); 2.8352 (6.38); 2.8166 (4.11); 2.7646 (2.77); 2.7539 (2.78); 2.7141 (1.98); 2.6968 (2.03); 2.5453 (1.57); 2.5359 (1.74); 2.5252 (2.61); 2.4955 (2.24); 2.4806 (1.35); 2.4645 (0.72); 2.1001 (0.47); 1.6234 (9.70); 1.3292 (0.33); 1.3138 (0.46); 0.0666 (0.35); 0.0558 (8.13); 0.0450 (0.39)

实施例 III-a-22, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.2558 (10.88); 7.0312 (1.45); 7.0058 (3.10); 6.9805 (1.86); 6.9021 (0.95); 6.6636 (2.69); 6.6389 (2.39); 6.5178 (2.91); 6.4919 (2.66); 3.5514 (2.33); 3.1791 (0.72); 3.1624 (0.83); 3.1549 (0.84); 3.1455 (0.86); 3.1297 (0.80); 3.1043 (0.41); 2.7821 (0.39); 2.7671 (0.48); 2.7533 (0.46); 2.7320 (1.09); 2.7165 (1.12); 2.7025 (1.14); 2.6874 (1.15); 2.6673 (0.94); 2.6411 (1.90); 2.6153 (1.40); 2.5903 (0.82); 2.5643 (0.51); 2.3607 (0.69); 2.3457 (0.67); 2.3344 (1.14); 2.3193 (1.80); 2.3078 (0.91); 2.3014 (2.00); 2.2929 (1.92); 2.2778 (1.23); 2.2665 (0.74); 2.2514 (0.63); 2.0449 (1.44); 1.7926 (0.41); 1.7756 (0.50); 1.7706 (0.68); 1.7627 (0.67); 1.7542 (0.68); 1.7462 (0.90); 1.7411 (0.98); 1.7331 (0.61); 1.7241 (1.72); 1.6989 (1.80); 1.6823 (1.09); 1.6697 (1.70); 1.6667 (2.00); 1.6574 (1.52); 1.6506 (1.96); 1.6457 (0.99); 1.6364 (1.01); 1.6325 (1.08); 1.6284 (1.48); 1.6228 (2.28); 1.6066 (1.98); 1.5930 (1.37); 1.5767 (1.33); 1.5456 (0.48); 1.3676 (1.26); 1.3514 (1.40); 1.3287 (16.00); 1.3182 (2.42); 1.3077 (2.40); 1.2905 (2.84); 1.2825 (2.67); 1.2666 (8.43); 1.2595 (7.51); 1.2354 (1.30); 0.9776 (15.40); 0.9664 (15.51); 0.9560 (15.92); 0.9449 (15.83); 0.9036 (3.18); 0.8819 (9.73); 0.8585 (3.71); -0.0002 (9.93); -0.0111 (0.46)

[0466]

实施例 III-a-25, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

6.8062 (2.45); 6.7808 (4.98); 6.7555 (2.93); 6.3423 (4.25); 6.3394 (4.44); 6.3162 (3.98); 6.3133 (3.88); 5.9043 (3.78); 5.9026 (3.83); 5.8797 (3.67); 4.7662 (6.44); 3.3231 (12.28); 3.2533 (0.90); 3.2479 (1.18); 3.2254 (1.83); 3.2029 (1.28); 3.1973 (1.03); 3.1800 (0.37); 3.1746 (0.33); 2.5125 (1.62); 2.5065 (3.58); 2.5004 (5.04); 2.4943 (3.71); 2.4883 (1.81); 2.4554 (2.03); 2.4273 (2.00); 2.4136 (2.34); 2.3855 (2.07); 1.4646 (2.77); 1.4584 (2.80); 1.4228 (2.58); 1.4166 (2.64); 1.1689 (16.00); 1.1462 (15.76); 0.9229 (0.60); 0.9169 (0.38); 0.9109 (0.58); 0.9038 (1.56); 0.8967 (2.71); 0.8895 (3.99); 0.8762 (4.28); 0.8722 (4.00); 0.8606 (2.61); 0.8417 (1.38); 0.7607 (0.83); 0.7380 (1.15); 0.7286 (1.99); 0.7177 (2.04); 0.7002 (1.61); 0.6903 (1.87); 0.6625 (2.06); 0.6564 (1.98); 0.6354 (2.60); 0.6289 (1.59); 0.6201 (0.81); 0.6152 (0.99); 0.5966 (0.50); -0.0002 (4.96)

实施例 III-a-26, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 499,93 MHz

6.8539 (1.00); 6.8388 (2.00); 6.8236 (1.13); 6.3753 (2.01); 6.3738 (2.11); 6.3597 (1.91); 6.3582 (1.96); 6.3240 (1.93); 6.3093 (1.83); 4.7005 (2.84); 3.2909 (2.53); 2.5807 (1.50); 2.5655 (2.83); 2.5517 (1.61); 2.5035 (0.37); 2.4999 (0.76); 2.4963 (1.04); 2.4926 (0.75); 2.4891 (0.36); 1.9843 (0.35); 1.9357 (0.58); 1.9213 (0.95); 1.9106 (0.85); 1.9077 (0.69); 1.8975 (0.91); 1.8957 (0.99); 1.8826 (0.68); 1.7230 (0.76); 1.7092 (1.04); 1.7070 (0.90); 1.6980 (0.70); 1.6932 (0.80); 1.6836 (0.99); 1.6682 (0.56); 1.5423 (0.70); 1.5301 (0.55); 1.5274 (0.80); 1.5153 (1.40); 1.5003 (1.36); 1.4851 (0.59); 1.4687 (1.29); 1.4538 (1.42); 1.4416 (0.76); 1.4391 (0.61); 1.4267 (0.70); 1.1957 (0.71); 1.1817 (0.70); 1.1533 (0.64); 1.1151 (16.00); 1.0266 (0.45); 1.0123 (0.45); 0.9633 (0.68); 0.9497 (0.68); 0.9451 (0.49); 0.9313 (0.43); 0.7737 (4.08); 0.7589 (8.61); 0.7439 (3.77); -0.0002 (0.57)

实施例 III-a-29, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

7.3776 (2.57); 7.2447 (4.00); 7.2237 (2.90); 7.2079 (3.53); 7.0925 (1.31); 7.0742 (1.17); 7.0380 (2.73); 4.0736 (4.34); 4.0515 (9.26); 4.0294 (4.65); 3.5676 (2.00); 3.5457 (1.23); 3.5243 (0.95); 3.5003 (0.35); 3.0513 (1.59); 3.0238 (1.63); 2.9886 (2.17); 2.9611 (1.73); 2.5144 (6.98); 2.5084 (15.56); 2.5023 (22.07); 2.4962 (17.05); 2.4906 (10.20); 2.4289 (1.93); 2.4218

[0467]

(1.98); 1.7159 (0.44); 1.6913 (2.05); 1.6685 (4.36); 1.6441 (4.59); 1.6213 (2.36); 1.5972 (0.59); 1.1999 (10.23); 1.1769 (10.32); 0.9415 (7.88); 0.9170 (16.00); 0.8921 (6.98); 0.0108 (0.43); -0.0002 (16.34); -0.0111 (0.80)

实施例 III-a-30, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

7.4105 (3.91); 7.2507 (4.63); 7.2411 (6.21); 7.2288 (3.21); 7.2035 (0.99); 7.1068 (1.51); 7.0712 (4.36); 4.1764 (2.06); 4.1529 (6.70); 4.1295 (6.90); 4.1061 (2.28); 3.5784 (0.83); 3.5676 (1.59); 3.5566 (1.23); 3.5339 (0.87); 3.0399 (1.45); 3.0122 (1.52); 2.9770 (2.04); 2.9496 (1.67); 2.5145 (4.19); 2.5088 (8.96); 2.5027 (12.39); 2.4967 (9.46); 2.4903 (5.89); 2.4812 (2.85); 2.4253 (1.83); 2.4184 (1.85); 1.9891 (0.35); 1.2702 (7.44); 1.2468 (16.00); 1.2233 (7.48); 1.1995 (10.08); 1.1765 (9.96); 0.0106 (0.46); -0.0002 (11.93); -0.0110 (0.63)

实施例 III-a-33, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

7.1077 (3.52); 7.0885 (4.40); 7.0697 (0.33); 6.9341 (4.41); 6.9143 (3.64); 6.8473 (1.52); 6.8416 (2.09); 6.8282 (3.04); 6.8228 (4.00); 6.8094 (1.92); 6.8037 (2.43); 6.4439 (2.73); 6.4243 (2.55); 6.3970 (3.43); 6.3762 (4.95); 6.3550 (3.44); 6.1569 (2.34); 6.1384 (2.23); 4.8173 (4.96); 4.7213 (5.17); 3.8800 (3.93); 3.3166 (41.39); 3.0366 (0.34); 3.0182 (1.46); 3.0001 (2.27); 2.9821 (1.60); 2.9643 (0.43); 2.7454 (1.53); 2.7270 (1.78); 2.7074 (1.82); 2.6890 (2.12); 2.6816 (0.55); 2.6768 (0.56); 2.6723 (0.41); 2.6162 (1.35); 2.5779 (3.58); 2.5625 (0.58); 2.5579 (0.74); 2.5537 (0.60); 2.5370 (3.21); 2.5305 (1.66); 2.5256 (2.11); 2.5168 (24.73); 2.5124 (51.89); 2.5078 (71.88); 2.5033 (52.84); 2.4988 (27.84); 2.4770 (3.47); 2.4600 (2.98); 2.4424 (2.25); 2.4246 (1.08); 2.4068 (0.41); 2.3979 (0.81); 2.3392 (0.46); 2.3346 (0.61); 2.3302 (0.48); 2.2817 (15.43); 2.2689 (2.65); 2.2465 (1.98); 2.2307 (1.69); 1.9953 (0.39); 1.2501 (0.54); 1.2063 (0.66); 1.1821 (0.59); 1.1677 (15.73); 1.0265 (15.45); 1.0085 (15.59); 0.9833 (0.41); 0.9326 (15.91); 0.9151 (16.00); 0.8835 (0.46); 0.8663 (0.90); 0.8487 (0.43); 0.6786 (0.62); 0.5866 (14.35)

实施例 III-a-34, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 499,93 MHz

7.2284 (0.85); 7.0242 (1.20); 7.0089 (2.47); 6.9937 (1.40); 6.6163 (2.38);

[0468]

6.6014 (2.24); 6.4748 (2.38); 6.4592 (2.29); 2.7430 (0.86); 2.7295 (0.96); 2.7250 (1.00); 2.7115 (0.94); 2.6981 (0.33); 1.6696 (0.34); 1.6556 (1.04); 1.6518 (0.48); 1.6416 (1.17); 1.6375 (1.13); 1.6274 (0.54); 1.6235 (1.09); 1.6095 (0.39); 1.4006 (8.82); 1.3872 (8.98); 1.2652 (16.00); 1.0667 (0.53); 1.0573 (8.85); 1.0433 (8.64); 0.9235 (0.67); 0.9113 (15.98); -0.0002 (0.48)

实施例 III-a-35, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.2567 (1.78); 6.9707 (0.50); 6.7834 (0.48); 6.7583 (0.37); 6.5322 (0.49); 6.5064 (0.43); 2.6673 (0.32); 2.1398 (0.37); 2.1111 (0.51); 2.0977 (0.32); 2.0834 (0.40); 0.9389 (16.00); -0.0002 (1.63)

实施例 III-a-36, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

6.8649 (0.38); 6.8396 (0.81); 6.8143 (0.47); 6.3768 (0.76); 6.3592 (0.75); 6.3509 (0.79); 6.3347 (0.65); 4.6977 (1.31); 3.3222 (3.74); 2.5247 (0.41); 2.5068 (1.39); 2.5007 (1.88); 2.4948 (1.51); 2.4886 (0.75); 2.4822 (0.55); 1.9883 (1.08); 1.7336 (0.39); 1.7273 (0.40); 1.6876 (0.52); 1.6814 (0.51); 1.3965 (0.44); 1.3643 (0.43); 1.3504 (0.39); 1.3261 (0.44); 1.3184 (0.41); 1.2834 (0.39); 1.2179 (2.90); 1.1952 (2.96); 1.1742 (0.68); 1.1504 (0.34); 0.9630 (16.00); 0.9107 (0.44); -0.0002 (1.49)

实施例 III-a-37, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

7.2046 (0.68); 7.1810 (2.09); 7.1559 (1.01); 7.1497 (0.86); 7.1260 (0.36); 3.5674 (0.34); 2.7604 (3.29); 2.7286 (3.64); 2.5142 (0.99); 2.5082 (2.17); 2.5022 (3.01); 2.4961 (2.23); 2.4902 (1.11); 1.1198 (16.00); -0.0002 (3.13)

实施例 III-a-39, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

6.8479 (1.11); 6.8226 (2.34); 6.7974 (1.42); 6.3860 (2.35); 6.3768 (2.19); 6.3600 (2.29); 6.3524 (2.00); 4.7040 (2.62); 3.3230 (6.94); 3.1364 (0.44); 3.1214 (0.52); 3.1136 (0.60); 3.1086 (0.57); 3.0982 (0.58); 3.0934 (0.60); 3.0854 (0.54); 3.0705 (0.46); 2.9616 (0.40); 2.9459 (0.55); 2.9307 (0.73); 2.9152 (0.62); 2.8997 (0.49); 2.5124 (0.81); 2.5064 (1.79); 2.5003 (2.52); 2.4942 (1.87); 2.4882 (0.92); 2.4479 (0.68); 2.4190 (1.21); 2.4050 (0.84); 2.3901 (0.66); 2.3761 (1.32); 2.3472 (0.62); 1.7578 (0.42); 1.7516 (0.38); 1.7392 (0.49); 1.7300 (0.56); 1.7175 (0.43); 1.7109 (0.60); 1.6892 (0.44); 1.5764 (0.62); 1.5589 (0.64); 1.5476 (0.47); 1.5319 (1.06); 1.5148 (0.84); 1.5036 (0.72); 1.4860 (0.66); 1.3338 (0.70); 1.3156 (0.78); 1.3094 (0.87);

[0469]

1.3004 (0.94); 1.2938 (1.50); 1.2825 (1.03); 1.2789 (1.00); 1.2717 (0.76);
1.2665 (0.85); 1.2562 (0.83); 1.2511 (1.29); 1.2361 (0.98); 1.2170 (8.66);
1.1941 (8.84); 1.1715 (0.67); 1.0666 (0.42); 1.0436 (0.41); 0.9490 (8.34);
0.9270 (16.00); 0.9139 (1.71); 0.9052 (8.06); 0.8922 (1.03); -0.0002 (1.64)

实施例 III-a-40, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

6.8522 (1.06); 6.8268 (2.30); 6.8015 (1.35); 6.3655 (2.97); 6.3616 (3.31);
6.3408 (2.40); 6.3357 (2.73); 4.7450 (3.40); 3.3251 (4.01); 2.8659 (0.88);
2.8406 (0.97); 2.8148 (1.05); 2.7894 (1.08); 2.5115 (0.51); 2.5055 (1.11);
2.4994 (1.55); 2.4933 (1.14); 2.4872 (0.57); 2.1609 (0.87); 2.1268 (1.04);
2.1098 (0.80); 2.0757 (0.95); 1.8063 (0.36); 1.7934 (0.36); 1.7824 (0.79);
1.7715 (0.66); 1.7578 (0.62); 1.7469 (0.76); 1.7363 (0.45); 1.7235 (0.34);
1.7109 (0.35); 1.6135 (0.44); 1.6008 (0.45); 1.5951 (0.32); 1.5884 (0.56);
1.5756 (0.61); 1.5700 (0.70); 1.5638 (0.39); 1.5572 (0.61); 1.5450 (0.69);
1.5322 (0.57); 1.3262 (0.51); 1.3020 (0.64); 1.2897 (0.53); 1.2823 (0.54);
1.2654 (0.64); 1.2583 (0.57); 1.2459 (0.50); 1.2326 (0.50); 1.2218 (0.59);
1.2008 (16.00); 1.1697 (0.38); 1.0145 (4.19); 0.9901 (8.60); 0.9656 (3.20);
0.8796 (0.43); 0.8576 (13.77); -0.0002 (1.12)

实施例 III-a-42, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

6.8207 (1.98); 6.8018 (3.88); 6.7914 (0.35); 6.7828 (2.34); 6.3630 (3.79);
6.3532 (4.36); 6.3447 (3.68); 6.3336 (3.84); 4.6956 (5.97); 3.3158 (7.04);
2.8179 (0.70); 2.8001 (2.27); 2.7822 (2.35); 2.7643 (0.81); 2.5302 (0.63);
2.5255 (1.00); 2.5168 (10.63); 2.5123 (22.07); 2.5077 (30.47); 2.5032
(21.91); 2.4987 (10.95); 2.4588 (1.33); 2.4196 (6.13); 2.4076 (6.06);
2.3683 (0.98); 1.4578 (0.34); 1.4392 (1.19); 1.4206 (1.60); 1.4047 (3.37);
1.3893 (4.51); 1.3866 (5.76); 1.3686 (5.21); 1.3506 (2.28); 1.3297 (2.24);
1.3112 (2.49); 1.2949 (1.58); 1.2765 (1.35); 1.2686 (0.33); 1.2581 (0.58);
1.0506 (14.73); 1.0327 (14.70); 0.9990 (0.38); 0.8423 (7.28); 0.8238
(15.83); 0.8050 (6.61); 0.7887 (7.51); 0.7702 (16.00); 0.7516 (6.61);
0.7333 (0.46); 0.7280 (0.43); 0.7095 (0.47)

实施例 III-a-43, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 499,93 MHz

10.1680 (0.35); 7.2824 (1.79); 7.2671 (4.88); 7.2519 (4.19); 7.2116 (5.54);
7.1949 (6.98); 7.1791 (3.68); 3.5633 (1.03); 3.5555 (1.26); 3.5479 (1.57);

[0470]

3.5408 (1.61); 3.5332 (1.32); 3.5252 (1.13); 3.5111 (0.34); 2.5064 (1.90); 2.5030 (2.54); 2.4995 (1.94); 2.1865 (2.39); 2.1696 (2.60); 2.1610 (2.94); 2.1442 (2.60); 1.8071 (2.07); 1.7939 (3.06); 1.7796 (6.07); 1.7765 (6.15); 1.7674 (7.69); 1.7447 (3.02); 1.7298 (3.09); 1.7147 (1.98); 1.7081 (2.06); 1.6943 (1.61); 1.6805 (4.19); 1.6724 (4.21); 1.6651 (1.78); 1.6548 (4.38); 1.6469 (4.23); 1.6289 (1.07); 1.2815 (15.85); 1.2674 (16.00); -0.0002 (1.00)

实施例 III-a-45, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.2531 (7.21); 7.1953 (0.34); 7.1743 (0.32); 7.1442 (0.36); 7.0437 (0.35); 7.0309 (1.66); 7.0183 (0.75); 7.0053 (3.43); 6.9929 (0.58); 6.9799 (2.09); 6.9782 (2.09); 6.7605 (0.40); 6.7295 (0.41); 6.5208 (3.24); 6.5049 (4.02); 6.5020 (3.41); 6.4983 (2.97); 6.4958 (3.03); 6.4792 (3.39); 6.4766 (2.74); 3.5775 (1.43); 3.2460 (0.75); 3.2225 (1.03); 3.2172 (0.91); 3.1979 (1.09); 3.1749 (0.82); 3.1522 (0.35); 2.7847 (1.22); 2.7569 (0.65); 2.7541 (0.63); 2.7009 (0.75); 2.6647 (0.43); 2.6494 (0.39); 2.6186 (0.37); 2.6003 (0.34); 2.5879 (0.34); 2.5794 (0.32); 2.5679 (0.43); 2.4798 (0.35); 2.4694 (0.47); 2.4144 (0.36); 2.3942 (0.33); 2.2253 (2.36); 2.1959 (2.33); 2.1812 (2.82); 2.1517 (2.58); 2.1281 (0.34); 2.1085 (0.42); 2.1022 (0.58); 2.0800 (0.41); 2.0653 (0.46); 2.0366 (0.39); 2.0130 (0.34); 2.0023 (0.37); 1.9909 (0.39); 1.9783 (0.37); 1.9651 (0.33); 1.9606 (0.33); 1.9339 (0.33); 1.9105 (0.47); 1.8841 (0.67); 1.8604 (0.55); 1.8320 (0.36); 1.8072 (0.35); 1.7936 (0.34); 1.7823 (0.38); 1.7742 (0.35); 1.7496 (0.42); 1.7271 (0.63); 1.7092 (1.10); 1.6882 (1.53); 1.6840 (1.36); 1.6736 (1.50); 1.6632 (3.39); 1.6489 (3.36); 1.6382 (3.84); 1.6243 (3.65); 1.6137 (2.80); 1.5997 (2.25); 1.5934 (2.25); 1.5891 (2.63); 1.5843 (3.94); 1.5784 (2.12); 1.5663 (4.77); 1.5528 (1.75); 1.5436 (3.80); 1.5403 (3.93); 1.5216 (3.52); 1.5124 (1.87); 1.5032 (1.13); 1.4873 (2.88); 1.4755 (1.17); 1.4626 (3.03); 1.4419 (1.92); 1.4384 (1.59); 1.4274 (0.81); 1.4173 (1.58); 1.4017 (0.68); 1.3928 (0.92); 1.3885 (0.72); 1.3447 (15.97); 1.3216 (16.00); 1.2791 (2.19); 1.2687 (1.01); 1.2612 (1.01); 1.2448 (1.49); 1.2369 (1.40); 1.2255 (1.66); 1.2213 (1.73); 1.2022 (2.31); 1.1808 (0.56); 1.1764 (0.56); 1.1527 (2.24); 1.1375 (0.72); 1.1141 (0.65); 1.0861 (0.36); 1.0613 (0.33); 1.0451 (0.40); 1.0267 (0.60); 1.0116

[0471]

(0.64); 1.0029 (0.64); 0.9871 (0.74); 0.9800 (0.45); 0.9623 (0.50); 0.9546 (0.48); 0.9202 (0.85); 0.8959 (1.57); 0.8640 (8.39); 0.8524 (1.80); 0.8392 (15.59); 0.8144 (6.95); 0.7615 (0.49); 0.7480 (0.74); 0.7375 (0.85); 0.7230 (1.48); 0.7151 (7.73); 0.6904 (14.92); 0.6656 (6.57); 0.6285 (0.56); 0.6161 (0.47); -0.0002 (6.02)

实施例 III-a-46, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.6710 (0.44); 7.2573 (17.26); 7.2222 (0.37); 7.1971 (0.39); 7.0480 (1.38); 7.0225 (2.96); 6.9971 (1.82); 6.8117 (0.64); 6.7866 (0.59); 6.7435 (0.44); 6.7360 (0.52); 6.5670 (1.64); 6.5591 (1.27); 6.5419 (1.50); 6.5364 (1.14); 6.5340 (1.14); 6.5105 (2.84); 6.5077 (2.63); 6.4847 (2.58); 6.4819 (2.41); 3.5922 (1.87); 3.2681 (0.43); 3.2458 (0.63); 3.2401 (0.70); 3.2231 (0.79); 3.2168 (0.77); 3.2003 (0.67); 3.1725 (0.37); 2.7602 (1.47); 2.7573 (1.44); 2.4586 (0.36); 2.3331 (0.92); 2.3041 (0.94); 2.2896 (1.10); 2.2608 (1.02); 2.0941 (1.22); 2.0654 (1.21); 2.0508 (1.65); 2.0221 (1.53); 2.0069 (0.32); 1.9970 (0.36); 1.9457 (0.42); 1.9277 (0.61); 1.8967 (0.35); 1.8923 (0.37); 1.8098 (0.34); 1.7196 (1.54); 1.7027 (1.71); 1.6764 (1.90); 1.6590 (1.98); 1.6517 (1.90); 1.6327 (2.05); 1.6266 (2.07); 1.6080 (2.09); 1.6017 (1.53); 1.5832 (1.71); 1.5767 (1.57); 1.5712 (1.62); 1.5621 (1.83); 1.5565 (1.96); 1.5487 (1.19); 1.5381 (1.06); 1.5317 (1.65); 1.5083 (2.53); 1.4923 (1.69); 1.4842 (1.47); 1.4646 (1.66); 1.4598 (1.01); 1.4489 (1.38); 1.4390 (0.72); 1.4250 (0.40); 1.4146 (0.41); 1.3468 (11.73); 1.3235 (12.07); 1.3067 (2.15); 1.2994 (2.18); 1.2742 (12.33); 1.2468 (1.05); 1.2233 (0.81); 1.2144 (0.80); 1.1781 (0.54); 1.1463 (16.00); 1.1298 (1.74); 1.1064 (1.06); 1.0830 (0.48); 1.0651 (0.34); 1.0484 (0.39); 1.0447 (0.37); 1.0244 (0.41); 1.0189 (0.39); 0.9957 (0.35); 0.9437 (0.54); 0.9232 (4.47); 0.8984 (9.10); 0.8818 (2.63); 0.8736 (4.06); 0.8588 (1.07); 0.8175 (0.38); 0.8035 (3.12); 0.7930 (0.73); 0.7787 (6.46); 0.7671 (0.78); 0.7539 (2.82); 0.0107 (0.47); -0.0002 (15.60); -0.0112 (0.68)

实施例 III-b-3, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 499,93 MHz

7.2765 (1.33); 7.2677 (1.84); 7.2588 (1.60); 7.2531 (4.18); 7.0390 (0.40); 7.0315 (3.92); 7.0238 (3.90); 4.1415 (0.36); 4.1272 (1.09); 4.1129 (1.10); 4.0987 (0.37); 3.0496 (1.05); 3.0346 (1.12); 3.0171 (0.95); 3.0021 (0.94);

[0472]

2.6001 (0.99); 2.5802 (1.03); 2.5677 (0.70); 2.5479 (0.71); 2.0387 (4.98); 1.8557 (0.33); 1.8506 (0.32); 1.8430 (0.36); 1.8379 (0.79); 1.8256 (1.23); 1.8205 (0.71); 1.8134 (1.37); 1.8085 (1.09); 1.8043 (0.42); 1.7934 (0.99); 1.7909 (0.44); 1.7755 (0.39); 1.5258 (3.30); 1.3893 (15.21); 1.3067 (0.68); 1.2703 (1.44); 1.2560 (2.79); 1.2417 (1.36); 1.2184 (1.30); 1.0934 (0.62); 1.0808 (6.79); 1.0725 (16.00); 1.0684 (7.38); 1.0192 (0.32); 1.0049 (0.35); 1.0029 (0.34); 0.9908 (0.38); 0.9803 (6.29); 0.9740 (1.16); 0.9678 (6.25); 0.9259 (1.33); -0.0002 (2.61)

实施例 III-b-4, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

7.3014 (6.92); 7.2995 (7.06); 7.2816 (8.33); 7.2797 (8.25); 7.0803 (4.53); 7.0612 (7.85); 7.0418 (4.29); 6.7415 (7.80); 6.7230 (6.95); 4.0716 (6.65); 3.3410 (102.99); 3.2917 (0.36); 2.9831 (6.97); 2.9755 (1.21); 2.9640 (11.47); 2.9448 (7.73); 2.5301 (0.61); 2.5253 (1.07); 2.5166 (16.87); 2.5121 (35.38); 2.5076 (48.15); 2.5031 (34.08); 2.4987 (15.75); 2.1276 (9.33); 2.1203 (1.44); 2.1080 (12.88); 2.0972 (1.35); 2.0892 (8.51); 1.2992 (0.35); 1.2825 (0.77); 1.2493 (3.74); 0.9756 (3.56); 0.9695 (3.72); 0.9628 (9.63); 0.9572 (14.28); 0.9488 (7.39); 0.9368 (3.19); 0.9135 (2.76); 0.9015 (8.88); 0.8933 (16.00); 0.8875 (11.86); 0.8807 (5.54); 0.8748 (5.56); 0.8625 (6.25); 0.8448 (2.52)

实施例 III-b-9, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz

7.6364 (1.05); 7.6109 (1.17); 7.4955 (1.08); 7.4929 (1.07); 7.4694 (1.28); 7.4668 (1.22); 7.2590 (1.33); 7.1549 (0.81); 7.1291 (1.39); 7.1032 (0.65); 3.9866 (16.00); 3.0219 (0.70); 3.0048 (1.16); 2.9914 (0.67); 2.9772 (1.38); 2.9070 (1.61); 2.9026 (1.59); 2.8956 (0.72); 2.8907 (1.00); 2.8826 (1.22); 2.8773 (1.52); 2.8721 (0.63); 2.8624 (0.92); 2.8580 (0.84); -0.0002 (0.85)

实施例 III-b-11, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz

7.2923 (0.36); 7.2793 (0.53); 7.2661 (0.48); 7.2565 (4.17); 7.1261 (0.35); 7.1051 (0.58); 7.0817 (0.63); 7.0012 (0.52); 6.9891 (0.37); 6.9756 (0.68); 3.1426 (0.53); 3.1163 (0.55); 3.0888 (0.55); 3.0601 (0.45); 3.0115 (0.48); 2.9456 (0.52); 2.9204 (0.33); 2.6239 (0.41); 2.5961 (0.37); 2.4005 (0.34); 2.3740 (0.43); 2.1049 (0.42); 2.0802 (0.60); 2.0549 (0.39); 1.5535 (1.32); 1.5287 (1.37); 1.5044 (1.05); 1.4802 (0.40); 1.3316 (0.65); 1.3077 (0.98);

[0473]

1.2890 (1.34); 1.2654 (5.44); 1.2595 (5.29); 0.9994 (1.77); 0.9749 (3.43); 0.9702 (1.35); 0.9565 (6.39); 0.9505 (2.18); 0.9407 (0.98); 0.9297 (16.00); 0.9186 (1.21); 0.9145 (1.07); 0.9038 (10.31); 0.8818 (6.36); 0.8584 (2.64); 0.8277 (0.57); 0.8199 (0.46); 0.8029 (0.47); 0.7950 (0.48); 0.7777 (0.37); 0.7520 (0.37); 0.5565 (2.50); 0.5552 (2.53); 0.5418 (0.39); 0.5302 (7.72); 0.5186 (0.61); 0.5157 (0.58); 0.5036 (6.94); 0.4774 (1.79); 0.4757 (1.78); 0.0705 (0.35); -0.0002 (1.93)

实施例 III-b-15, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.3950 (1.30); 7.3914 (1.72); 7.3863 (1.21); 7.3706 (3.16); 7.3658 (4.19); 7.3625 (3.43); 7.3519 (2.06); 7.3433 (7.82); 7.3172 (3.96); 7.3044 (13.00); 7.2953 (2.80); 7.2915 (3.11); 7.2752 (8.42); 7.2685 (5.63); 7.2503 (5.14); 7.1995 (0.51); 7.1777 (1.09); 7.1661 (0.59); 7.1517 (2.47); 7.1271 (3.73); 7.1047 (0.49); 7.0631 (2.85); 7.0375 (3.64); 7.0123 (1.59); 4.1867 (0.38); 4.1387 (0.41); 3.1621 (0.62); 3.1391 (1.55); 3.1228 (1.40); 3.1092 (1.48); 3.0929 (2.03); 3.0810 (1.82); 3.0738 (1.81); 2.8838 (1.02); 2.8651 (0.95); 2.8422 (8.66); 2.8189 (1.75); 2.8119 (1.66); 2.8017 (2.20); 2.7929 (1.96); 2.7836 (2.43); 2.7331 (1.11); 2.7166 (0.95); 2.0973 (0.95); 1.5958 (15.88); 1.5765 (0.41); 1.5559 (0.33); 1.4850 (0.73); 1.3824 (1.16); 1.3591 (2.24); 1.3101 (16.00); 1.2817 (2.70); 1.2578 (1.39); 1.2012 (0.67); 1.1752 (0.56); 1.1406 (0.56); 1.0100 (0.63); 0.9887 (1.01); 0.9833 (0.98); 0.9569 (4.49); 0.9351 (13.16); 0.9116 (6.22); 0.8859 (1.82); 0.0915 (0.32); 0.0534 (6.53)

实施例 III-b-16, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

7.3460 (3.25); 7.3202 (4.02); 7.1985 (2.49); 7.1738 (4.33); 7.1198 (3.14); 7.0943 (3.91); 7.0691 (1.51); 5.7591 (0.44); 4.1230 (0.34); 4.0936 (0.40); 4.0651 (0.33); 4.0414 (0.57); 4.0177 (0.55); 3.3283 (0.97); 3.2889 (0.46); 3.2637 (0.88); 3.2479 (1.07); 3.2292 (1.04); 3.2153 (0.92); 3.1703 (3.99); 2.9320 (0.48); 2.9165 (0.57); 2.9028 (0.55); 2.8868 (0.69); 2.8775 (1.39); 2.8620 (1.56); 2.8484 (1.55); 2.8326 (1.65); 2.8249 (1.41); 2.7979 (2.56); 2.7710 (1.74); 2.7435 (0.96); 2.7168 (0.56); 2.5148 (1.91); 2.5091 (3.98); 2.5032 (5.40); 2.4972 (4.03); 2.4914 (2.02); 2.3116 (0.63); 2.2960 (0.66); 2.2851 (1.20); 2.2698 (1.80); 2.2586 (0.96); 2.2544 (0.95); 2.2433 (1.86); 2.2280 (1.24); 2.2170 (0.80); 2.2014 (0.65); 1.9895 (2.42); 1.9100 (1.88);

[0474]

1.7396 (0.42); 1.7316 (0.37); 1.7176 (0.76); 1.7098 (0.83); 1.7025 (0.72); 1.6936 (1.10); 1.6882 (1.15); 1.6731 (1.85); 1.6673 (1.20); 1.6520 (2.65); 1.6487 (2.65); 1.6369 (2.18); 1.6222 (1.95); 1.6100 (2.75); 1.5943 (2.62); 1.5803 (2.29); 1.5645 (1.29); 1.5520 (0.72); 1.3281 (1.09); 1.3130 (1.51); 1.2950 (1.46); 1.2857 (1.89); 1.2795 (2.02); 1.2715 (1.23); 1.2524 (1.30); 1.2370 (1.07); 1.1990 (0.69); 1.1753 (1.28); 1.1516 (0.69); 0.9580 (15.29); 0.9486 (16.00); 0.9368 (15.88); 0.9276 (15.73); 0.8998 (0.80); 0.8747 (0.98); 0.8615 (0.83); 0.8511 (0.73); 0.8390 (0.49); 0.8315 (0.48); 0.8220 (0.34); -0.0002 (4.55)

实施例 III-b-20, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

7.2942 (3.39); 7.2927 (3.49); 7.2745 (4.11); 7.2730 (4.12); 7.0810 (2.78); 7.0619 (5.03); 7.0425 (2.60); 6.7444 (4.12); 6.7257 (3.68); 4.0731 (0.64); 3.3319 (0.33); 3.3151 (8.38); 3.2969 (1.94); 3.2794 (1.32); 3.2619 (0.35); 3.2588 (0.33); 2.5802 (1.96); 2.5591 (2.01); 2.5485 (2.19); 2.5272 (2.26); 2.5162 (7.31); 2.5119 (14.76); 2.5075 (19.90); 2.5031 (14.21); 2.4989 (6.76); 1.5616 (2.84); 1.5580 (2.85); 1.5299 (2.68); 1.5263 (2.70); 1.2857 (16.00); 1.2683 (15.84); 1.0847 (0.80); 1.0760 (0.50); 1.0689 (1.93); 1.0606 (2.73); 1.0527 (4.04); 1.0455 (4.49); 1.0393 (2.64); 1.0314 (2.06); 1.0237 (0.66); 1.0158 (1.05); 0.8725 (1.24); 0.8642 (2.03); 0.8510 (1.24); 0.8475 (1.88); 0.8420 (1.78); 0.8354 (1.49); 0.8184 (0.78); 0.7869 (0.91); 0.7708 (1.49); 0.7630 (2.18); 0.7554 (2.35); 0.7397 (1.52); 0.7320 (0.94)

实施例 III-b-21, 溶剂: CDCl₃, 光谱仪: 300,16 MHz

7.8261 (0.33); 7.8227 (0.37); 7.8174 (0.33); 7.8143 (0.34); 7.8032 (0.64); 7.7971 (0.48); 7.7771 (0.51); 7.4166 (0.40); 7.4134 (0.36); 7.4048 (0.33); 7.3713 (0.54); 7.3453 (7.01); 7.3428 (6.97); 7.3191 (8.33); 7.3166 (8.38); 7.3046 (17.58); 7.2793 (0.44); 7.2676 (0.46); 7.2541 (0.39); 7.2429 (0.39); 7.2283 (0.54); 7.2008 (4.91); 7.1995 (5.08); 7.1980 (5.00); 7.1762 (6.94); 7.1748 (7.11); 7.1734 (6.95); 7.1544 (1.61); 7.1286 (1.77); 7.1051 (0.37); 7.0969 (0.52); 7.0857 (0.33); 7.0655 (5.91); 7.0400 (8.09); 7.0221 (2.22); 7.0146 (3.79); 6.9976 (0.88); 4.2510 (0.33); 4.2400 (0.68); 4.2337 (0.37); 4.2272 (0.37); 4.2162 (1.87); 4.2101 (0.46); 4.1925 (1.97); 4.1688 (0.71); 3.6484 (0.48); 3.5923 (0.61); 3.5635 (0.56); 3.5063 (0.71); 3.1870 (0.79);

[0475]

3.1617 (1.33); 3.1344 (1.96); 3.1078 (2.03); 3.0863 (6.94); 3.0614 (12.86); 3.0361 (7.83); 3.0201 (7.99); 2.9953 (14.10); 2.9701 (8.75); 2.9129 (0.44); 2.8974 (0.38); 2.8835 (0.35); 2.8718 (0.41); 2.8171 (0.81); 2.7876 (0.87); 2.7642 (0.58); 2.7336 (0.72); 2.7224 (0.84); 2.6931 (0.92); 2.6683 (0.75); 2.6387 (0.74); 2.3885 (0.33); 2.3835 (0.33); 2.3589 (0.53); 2.3318 (0.78); 2.3029 (0.73); 2.2752 (0.43); 2.1800 (3.64); 2.1684 (0.65); 2.1544 (11.57); 2.1446 (1.43); 2.1298 (16.00); 2.1169 (1.65); 2.1044 (10.55); 2.0932 (1.05); 2.0797 (3.07); 2.0619 (0.37); 1.9505 (0.40); 1.9459 (0.38); 1.9348 (0.33); 1.9227 (0.67); 1.8984 (1.20); 1.8845 (1.51); 1.8725 (1.28); 1.8625 (1.19); 1.8569 (0.98); 1.8475 (0.80); 1.8374 (0.76); 1.8279 (0.68); 1.8110 (0.49); 1.8040 (0.48); 1.7989 (0.45); 1.7275 (1.53); 1.7160 (1.42); 1.7060 (1.57); 1.6977 (1.76); 1.6892 (1.62); 1.6855 (1.59); 1.6811 (1.63); 1.6782 (1.63); 1.6741 (1.60); 1.6685 (1.68); 1.6552 (1.82); 1.6403 (1.81); 1.6304 (2.02); 1.6220 (1.85); 1.6138 (2.04); 1.5903 (1.60); 1.5869 (1.59); 1.5784 (1.40); 1.4967 (0.35); 1.4741 (0.39); 1.4436 (0.35); 1.4297 (0.33); 1.4001 (0.34); 1.3854 (0.34); 1.3753 (0.35); 1.3686 (0.36); 1.3513 (0.46); 1.3339 (2.53); 1.3101 (5.78); 1.2864 (3.98); 1.2627 (1.57); 1.2549 (1.15); 1.2431 (0.85); 1.0254 (0.39); 1.0083 (0.88); 0.9814 (2.09); 0.9719 (0.33); 0.9556 (1.18); 0.9475 (0.35); 0.9312 (0.32); 0.6067 (0.33); 0.5818 (0.95); 0.5553 (0.85); 0.0519 (8.75); 0.0410 (0.40)

实施例 III-b-22, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.6336 (2.49); 7.6315 (2.60); 7.6081 (2.81); 7.6059 (2.91); 7.4865 (2.89); 7.4833 (2.91); 7.4603 (3.45); 7.4572 (3.27); 7.2595 (7.89); 7.1420 (2.26); 7.1404 (2.29); 7.1160 (3.85); 7.1148 (3.87); 7.0904 (1.83); 7.0889 (1.82); 4.1523 (5.14); 4.1299 (10.89); 4.1076 (5.50); 3.4513 (0.66); 3.4451 (0.85); 3.4229 (1.26); 3.4004 (0.95); 3.3942 (0.84); 3.0724 (2.12); 3.0447 (1.87); 3.0098 (2.93); 2.9821 (2.54); 2.6740 (3.23); 2.6672 (3.25); 2.6115 (2.39); 2.6047 (2.42); 1.7966 (0.54); 1.7717 (2.13); 1.7491 (4.32); 1.7245 (4.55); 1.7018 (2.41); 1.6776 (0.70); 1.5674 (7.66); 1.3572 (15.28); 1.3340 (15.16); 1.2558 (0.98); 1.0094 (0.35); 0.9996 (7.96); 0.9749 (16.00); 0.9501 (7.07); 0.8806 (0.34); 0.8554 (0.32); -0.0002 (5.78)

实施例 III-b-23, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

[0476]

7.6373 (2.06); 7.6352 (2.15); 7.6119 (2.33); 7.6098 (2.38); 7.4877 (2.32); 7.4847 (2.32); 7.4616 (2.76); 7.4586 (2.63); 7.2593 (4.60); 7.1433 (1.87); 7.1423 (1.86); 7.1171 (3.23); 7.0918 (1.48); 7.0907 (1.47); 4.2609 (2.11); 4.2374 (6.71); 4.2139 (6.88); 4.1904 (2.31); 3.4519 (0.57); 3.4459 (0.71); 3.4236 (1.08); 3.4011 (0.80); 3.3950 (0.69); 3.0657 (1.75); 3.0380 (1.55); 3.0032 (2.39); 2.9755 (2.10); 2.6733 (2.64); 2.6666 (2.63); 2.6108 (1.94); 2.6041 (1.94); 1.5753 (4.45); 1.3560 (13.02); 1.3508 (8.57); 1.3328 (13.46); 1.3273 (16.00); 1.3037 (7.50); 1.2888 (0.71); 1.2568 (2.26); 1.2439 (0.77); 1.2200 (0.44); 0.9032 (0.63); 0.8815 (1.95); 0.8580 (0.89); -0.0002 (3.65)

实施例 III-b-24, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 400,13 MHz

7.6282 (1.60); 7.6091 (1.72); 7.4893 (1.61); 7.4698 (1.78); 7.2578 (1.68); 7.1394 (1.54); 7.1201 (2.35); 7.1008 (1.04); 3.9936 (2.39); 3.9855 (16.00); 3.4442 (0.42); 3.4403 (0.52); 3.4233 (0.79); 3.4063 (0.55); 3.4022 (0.50); 3.0401 (1.12); 3.0193 (1.01); 2.9932 (1.41); 2.9724 (1.27); 2.6554 (1.50); 2.6505 (1.50); 2.6085 (1.17); 2.6036 (1.18); 1.5771 (0.98); 1.3489 (7.38); 1.3377 (1.38); 1.3315 (7.35); 1.3207 (1.04); -0.0002 (1.38)

实施例 III-b-25, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

8.2558 (0.73); 8.2301 (0.77); 7.5752 (0.50); 7.5496 (0.55); 7.5336 (0.76); 7.5310 (0.73); 7.5072 (0.88); 7.5046 (0.83); 7.4804 (0.52); 7.4779 (0.50); 7.4543 (0.61); 7.4518 (0.55); 7.2578 (2.11); 7.1720 (0.50); 7.1459 (0.90); 7.1328 (0.40); 7.1197 (0.47); 7.1069 (0.63); 3.9882 (9.79); 3.9698 (0.34); 3.9197 (6.56); 2.8834 (3.29); 2.8626 (2.28); 1.5752 (1.19); 1.4760 (10.94); 1.3220 (16.00); 1.2843 (0.61); 1.2597 (2.14); 0.9033 (0.64); 0.8816 (2.06); 0.8583 (0.77); -0.0002 (1.31)

实施例 III-b-26, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 400,13 MHz

7.4214 (1.39); 7.4016 (1.53); 7.3365 (3.82); 7.3168 (4.60); 7.2293 (0.65); 7.2058 (3.30); 7.1875 (4.99); 7.1678 (0.63); 7.1529 (2.33); 7.1335 (3.28); 7.1224 (4.09); 7.1036 (5.00); 7.0844 (2.08); 6.9533 (3.00); 6.9344 (2.71); 4.1362 (2.20); 3.3364 (19.15); 3.3347 (21.41); 3.2547 (1.82); 3.2366 (2.56); 3.2191 (1.83); 3.2013 (0.60); 2.9911 (0.68); 2.9855 (0.77); 2.9798 (0.75); 2.9688 (2.39); 2.9476 (2.62); 2.9325 (1.18); 2.9242 (1.00); 2.8488

[0477]

(0.32); 2.8017 (3.70); 2.6761 (0.58); 2.5819 (0.85); 2.5646 (2.07); 2.5482 (3.53); 2.5361 (5.16); 2.5320 (4.47); 2.5071 (98.02); 2.4597 (1.28); 2.4184 (0.67); 2.3337 (0.68); 2.2956 (8.11); 2.0660 (1.07); 1.9940 (1.01); 1.4495 (0.34); 1.4336 (0.34); 1.2989 (0.46); 1.2829 (0.43); 1.2757 (0.37); 1.2636 (0.67); 1.2312 (0.57); 1.1923 (7.78); 1.1788 (0.82); 1.1609 (0.49); 1.1297 (0.53); 1.0906 (15.95); 1.0726 (16.00); 1.0384 (0.46); 0.9699 (0.34); 0.9590 (0.44); 0.9363 (13.48); 0.9194 (13.47); 0.9028 (1.23); 0.7650 (0.55); 0.7491 (0.50); 0.7003 (0.42); 0.6057 (7.33)

实施例 III-b-27, 溶剂: CDCl_3 , 光谱仪: 300,16 MHz

7.2853 (0.64); 7.2570 (2.11); 7.0886 (0.42); 7.0643 (0.72); 7.0061 (0.57); 6.9805 (0.73); 2.9489 (0.37); 2.8140 (2.61); 2.7639 (2.93); 1.5473 (0.48); 1.2595 (1.79); 1.1625 (16.00); 1.0001 (0.65); 0.9732 (1.66); 0.9473 (0.93); 0.6102 (0.78); 0.5835 (0.70); -0.0002 (1.26)

实施例 III-b-29, 溶剂: DMSO, 光谱仪: 300,16 MHz

7.3333 (1.68); 7.3310 (1.64); 7.3079 (2.19); 7.3056 (2.10); 7.1888 (1.24); 7.1663 (2.85); 7.1352 (1.97); 7.1101 (2.26); 7.0852 (0.84); 3.3277 (2.83); 3.0196 (1.07); 2.9939 (1.16); 2.9662 (1.34); 2.9405 (1.37); 2.5094 (1.89); 2.4988 (0.92); 2.4738 (1.35); 2.4556 (0.96); 2.4203 (1.08); 1.9274 (0.36); 1.9144 (0.37); 1.9040 (0.86); 1.8919 (0.74); 1.8789 (0.68); 1.8671 (0.87); 1.8565 (0.44); 1.8436 (0.36); 1.8307 (0.35); 1.6277 (0.48); 1.6144 (0.49); 1.6026 (0.58); 1.5889 (0.64); 1.5838 (0.73); 1.5708 (0.62); 1.5588 (0.70); 1.5458 (0.60); 1.3501 (0.56); 1.3259 (0.69); 1.3139 (0.60); 1.3056 (0.60); 1.2909 (0.93); 1.2699 (16.00); 1.2464 (0.77); 1.2334 (0.39); 1.2226 (0.35); 1.0527 (0.41); 1.0297 (0.34); 1.0106 (4.32); 0.9861 (8.26); 0.9616 (3.41); 0.9474 (0.75); 0.9217 (14.43); -0.0002 (0.52)

[0478] 尖峰信号的强度与在NMR光谱输出的实例中以cm计的信号高度相关,并且示出了信号强度的真实比例。对于宽峰信号,与光谱中最强的信号相比,可以示出几个峰或信号的中点以及其相对强度。

[0479] 为了校准 ^1H 光谱的化学位移,使用四甲基硅烷和/或所用溶剂的化学位移,特别是在DMSO中测定的光谱。因此在NMR峰列表中,可能但不一定出现四甲基硅烷的峰。

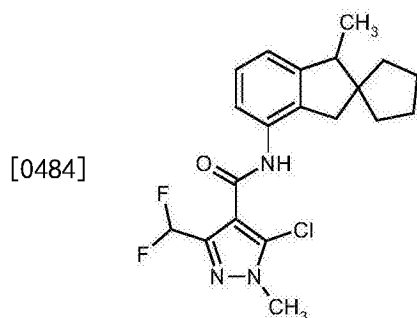
[0480] ^1H -NMR峰列表与典型的 ^1H -NMR输出类似,因此通常包含在典型的 ^1H -NMR解释中列出的所有峰。此外,与常规的 ^1H NMR输出一样,它们可以显示出溶剂信号、目标化合物的立体异构体的信号——其同样构成本发明的主题的一部分——和/或杂质峰。

[0481] 为了显示溶剂和/或水的 δ 范围内的化合物信号,溶剂的常见峰(例如DMSO- D_6 中的

DMSO峰和水峰)显示在我们的¹H-HMR峰列表中,并且其通常具有平均较高的强度。目标化合物的立体异构体的峰和/或杂质峰通常具有比目标化合物(例如具有>90%的纯度)的峰平均更低的强度。这类立体异构体和/或杂质对于具体的制备方法而言可以是典型的。因此,它们的峰可以借助于“副产物指纹(by-product fingerprint)”帮助识别我们的制备方法的再现性。利用已知方法(MestreC,ACD模拟,而且凭经验计算的预期值)计算出目标化合物的峰的专业人员可——如果需要——任选使用另外的强度滤波器来分离目标化合物的峰。这种分离将与典型的¹H-NMR解读中拾取相关峰相似。以峰列表形式表示的NMR数据的详细描述可以在公开出版物Research Disclosure Database Number 564025的“Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications”中找到。

[0482] 实验实施例

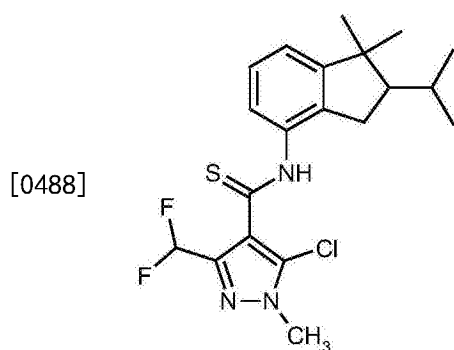
[0483] 方法(a)



[0485] 5-氯-3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1'-甲基-1',3'-二氢螺[环戊烷-1,2'-茚]-4'-基)-1H-吡唑-4-甲酰胺(实施例33)

[0486] 在25ml的圆底烧瓶中,将溶解在5ml DCM中的1'-甲基-1',3'-二氢螺[环戊烷-1,2'-茚]-4'-胺溶液冷却到0℃,加入三乙胺(0.104ml,0.745mmol,1.5当量),随后加入DMAP(6mg,0.05mmol,0.1当量)。逐滴加入溶解在1ml DCM中的5-氯-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-碳酰氯溶液。室温搅拌4h。用1N的HCl水溶液淬灭反应,并用EtOAc进行稀释。分离出水层,并用EtOAc萃取。合并有机相,用1N的NaOH溶液洗涤,用MgSO₄干燥,并浓缩。粗产品通过硅胶柱层析法进行纯化以获得纯品(64%)。

[0487] 方法(b)

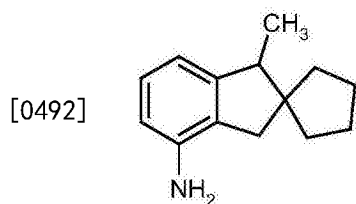


[0489] 5-氯-3-(二氟甲基)-N-(2-异丙基-1,1-二甲基-2,3-二氢-1H-茚-4-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-硫代酰胺(carbothioamide)(实施例94)

[0490] 在一个密封的微波管中,向溶解在2ml二氧六环中的5-氯代-3-(二氟甲基)-N-(2-异丙基-1,1-二甲基-2,3-二氢-1H-茚-4-基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲酰胺溶液(104mg,

0.264mmol, 1当量) 中加入 P_2S_5 (29mg, 0.132mmol, 0.5当量)。管子是密封的, 反应在130℃下微波加热20分钟。所得溶液通过氧化铝过滤并用二氧六环洗涤。蒸发掉溶剂, 残余物通过硅胶柱层析法进行纯化以获得纯品 (89%)。

[0491] 方法(c)



[0493] 3'-甲基-2',3'-二氢螺[环丙烷-1,1'-茚]-4'-胺(实施例III-a-17)

[0494] 在一个密封的反应器中, 将4'-溴代-1'-甲基-1',3'-二氢螺[环戊烷-1,2'-茚] (1当量) 溶解在1,4-二氧六环 (15ml可溶解250mg SM), 在加入叔丁基氨基甲酸酯 (tBu-carbamate) (1.5当量) 后, 加入XPHOS (0.1当量) 和碳酸铯 (2当量)。向溶剂中通入氩气5分钟, 并用氩气充分吹扫反应器。然后加入乙酸钡 (0.05当量), 并密封管子。将反应加热到100℃, 直到LCMS显示没有原料剩余。反应用EA稀释, 并通过硅藻土过滤。真空下除去溶剂, 并将残余物溶解在DCM中。加入TFA (10当量)。回流5h, 冷却, 用饱和的 $NaHCO_3$ 盐淬灭反应, 并用EA萃取。用 $MgSO_4$ 干燥并浓缩。残余物在硅胶中纯化以获得纯品 (73%)。

[0495] 实施例: 芸苔链格孢菌 (*Alternaria brassicae*) 的体内预防测试 (萝卜叶斑病)

[0496] 被测试的活性成分通过在丙酮/tween/DMSO的混合物中匀质化制得, 然后用水稀释以获得所需的活性物质浓缩液。

[0497] 萝卜植物 ("Pernod Clair" 种类), 种于50/50泥炭土-火山灰培养基的起始杯中, 生长于17℃下, 在子叶阶段通过喷洒如上制备的活性成分进行处理。用作对照组的植物用不包含活性物质的丙酮/tween/DMSO/水的混合物进行处理。

[0498] 24小时之后, 通过在子叶上喷洒芸苔链格孢菌 (*Alternaria brassicae*) 孢子 (每毫升50000个孢子) 的水性悬浮液来感染植物。孢子收集自培养时间为15天的培养基。将感染的萝卜植物置于20℃、相对湿度100%的条件下进行培养。

[0499] 感染6天后, 与对照组植物进行对比来进行分级 (功效, %)。

[0500] 在此条件下, 当以下化合物的剂量为500ppm时, 可观察到良好的 (至少70%) 或全面的保护:

[0501]

实施例编号	功效%
5	100
6	78
11	92
12	94
14	97
19	75
22	86
26	72

28	71
32	93
33	86
34	93
35	79
37	97
39	79
40	97
41	95
46	86
50	93
53	79
61	75

[0502]

64	100
66	97
70	89
73	83
78	95
80	97
83	86
86	96
87	75
90	90
91	86
101	100

[0503] 在此条件下,当以下化合物的剂量为100ppm时,可观察到良好的(至少70%)或全面的保护:

[0504]

实施例编号	功效%
107	97

[0505] 实施例:灰葡萄孢菌(*Botrytis cinerea*)的体内预防测试(灰霉病)

[0506] 被测试的活性成分通过在丙酮/tween/DMSO的混合物中匀质化制得,然后用水稀释以获得所需的活性物质浓缩液。

[0507] 小黄瓜植物(“Vert petit de Paris”种类),种于50/50泥炭土-火山灰培养基的起始杯中,生长于24℃下,在Z11子叶阶段通过喷洒如上制备的活性成分进行处理。用作对照组的植物用不包含活性物质的丙酮/tween/DMSO/水的混合物进行处理。

[0508] 24小时之后,通过在子叶上喷洒冷藏保存的灰葡萄孢菌孢子(每毫升50000个孢子)的水性悬浮液来感染植物。孢子悬浮在由10g/L PDB、50g/L D-果糖、2g/LNH₄NO₃和1g/

LKH₂PO₄组成的营养液中。将感染的小黄瓜植物置于17℃、相对湿度90%的条件下进行培养。

[0509] 感染4至5天后,与对照组植物进行对比而进行分级(功效,%)。

[0510] 在此条件下,当以下化合物的剂量为500ppm时,可观察到良好的(至少70%)或全面的保护:

[0511]

实施例编号	功效%
11	98
17	98
19	98
50	100
51	94
60	100
64	100
78	75

[0512] 在此条件下,当以下化合物的剂量为100ppm时,可观察到良好的(至少70%)或全面的保护:

[0513]

实施例编号	功效%
103	100
107	100

[0514] 在相同条件下,当实施例12和实施例34的化合物作为活性成分的剂量为100ppm时,可观察到良好的(至少70%)至极好的(至少80%)保护效果,然而公开于专利申请W01992012970中的化合物A具有低的保护效果:

[0515]	实施例	剂量 (ppm)	功效
	本发明的实施例 12	100	81

[0516]	本发明的实施例 34	100	79
	WO2012084812 的化合物 1	100	43

[0517] 实施例:圆核腔菌(Pyrenophora teres)的体内预防测试(大麦网斑病)

[0518] 被测试的活性成分通过在丙酮/tween/DMSO的混合物中匀质化制得,然后用水稀释以获得所需的活性物质浓缩液。

[0519] 大麦植物(“Plaisant”种类),种于50/50泥炭土-火山灰培养基的起始杯中,生长于22℃下,在1叶阶段(10cm高)通过喷洒如上制备的活性成分进行处理。用作对照组的植物用不包含活性物质的丙酮/tween/DMSO/水的混合物进行处理。

[0520] 24小时之后,通过在叶子上喷洒圆核腔菌孢子(每毫升12000个孢子)的水性悬浮液来感染植物。孢子收集自培养时间为12天的培养基。将感染的大麦植物置于20℃、相对湿度100%的条件下培养48h,然后置于20℃、相对湿度70%-80%的条件下培养12天。

[0521] 感染14天后,与对照组植物进行对比来进行分级(功效,%)。

[0522] 在此条件下,当以下化合物的剂量为500ppm时,可观察到良好的(至少70%)或全面的保护:

[0523]

实施例编号	功效%
11	80
15	71
17	97
19	97
20	97
30	83
32	97
34	97
36	75
37	75
40	80
46	75
49	83
50	80
51	70
52	80
53	80
55	75
57	97
60	100
64	97

[0524]

66	80
79	92
80	97
82	75
83	83
84	75
85	92
86	92
90	75
91	83
97	83

[0525] 在此条件下,当以下化合物的剂量为100ppm时,可观察到良好的(至少70%)或全

面的保护:

[0526]

实施例编号	功效%
92	70
95	70
103	80
105	70
106	80

[0527] 在相同条件下,当实施例34和实施例64的化合物作为有效成分的剂量为100ppm时,可观察到优异的(至少90%)保护的效果,然而公开于专利申请W01992012970中的化合物A和公开于专利申请W02012084812中的化合物1具有低的保护效果:

[0528]	实施例	剂量 (ppm)	功效
	本发明的实施例 34	100	92
	本发明的实施例 64	100	92
	WO1992012970 的化合物 A	100	64
	WO2012084812 的化合物 1	100	38

[0529] 实施例:稻梨孢菌 (*Pyricularia oryzae*) 的体内预防测试 (稻瘟病)

[0530] 被测试的活性成分通过在丙酮/tween/DMSO的混合物中匀质化制得,然后用水稀释以获得所需的活性物质浓缩液。

[0531] 稻植物 (“Koshihikari” 种类), 种于50/50泥炭土-火山灰培养基的起始杯中, 生长于26℃下, 在2叶阶段 (10cm高) 通过喷洒如上制备的活性成分进行处理。用作对照组的植物用不包含活性物质的丙酮/tween/DMSO/水的混合物进行处理。

[0532] 24小时之后, 通过在叶子上喷洒稻梨孢菌孢子 (每毫升40000个孢子) 的水性悬浮液来感植物染。孢子收集自培养时间为15天的培养基, 并且悬浮于含有2.5g/l明胶的水中。将感染的稻植物置于25℃、相对湿度80%的条件下进行培养。

[0533] 感染6天后, 与对照组植物进行对比来进行分级 (功效, %)。

[0534] 在此条件下, 当以下化合物的剂量为500ppm时, 可观察到良好的 (至少70%) 或全面的保护:

[0535]

实施例编号	功效%
39	86
45	83
46	97

[0536] 在此条件下, 当以下化合物的剂量为100ppm时, 可观察到良好的 (至少70%) 或全面的保护:

[0537]

实施例编号	功效%
-------	-----

89	93
----	----

[0538] 在相同条件下,当实施例46的化合物作为活性成分的剂量为500ppm时,可观察到优异的(至少90%)保护效果,然而公开于专利申请W02012084812中的化合物1并没有观察到保护效果。

[0539]	实施例	剂量 (ppm)	功效
	本发明的实施例 46	500	97
	WO2012084812 的化合物 1	500	0

[0540] 实施例:隐匿柄锈菌 (*Puccinia recondita*) 的体内预防测试 (小麦锈病)

[0541] 被测试的活性成分通过在丙酮/tween/DMSO的混合物中匀质化制得,然后用水稀释以获得所需的活性物质浓缩液。

[0542] 小麦植物 (“Scipion” 种类), 种于50/50泥炭土-火山灰培养基的起始杯中, 生长于22℃下, 在1叶阶段 (10cm高) 通过喷洒如上制备的活性成分进行处理。用作对照组的植物用不包含活性物质的丙酮/tween/DMSO/水的混合物进行处理。

[0543] 24小时之后, 通过在叶子上喷洒隐匿柄锈菌孢子 (每毫升100000个) 的水性悬浮液来感染植物。孢子收集自被感染的植物, 并且以10%的浓度悬浮于含有2.5ml/l Tween 80的水中。将感染的小麦植物置于20℃、相对湿度100%的条件下培养24h, 然后置于20℃、相对湿度70%至80%的条件下培养10天。

[0544] 感染12天后, 与对照组植物进行对比来进行分级 (功效, %)。

[0545] 在此条件下, 当以下化合物的剂量为500ppm时, 可观察到良好的 (至少70%) 或全面的保护:

[0546]

实施例编号	功效%
5	100
6	100
7	98
8	94
11	98
12	93
13	75
14	100
15	100
16	94
17	94
18	78
19	94
20	98
21	98

26	94
27	72
29	98
30	100
31	100

[0547]

32	100
33	93
34	97
35	97
38	71
40	100
41	97
42	100
43	98
44	100
45	100
46	100
47	83
48	100
49	94
50	98
51	98
52	98
53	100
54	94
55	94
56	83
57	94
58	75
59	86
61	86
62	94
64	100
65	94
66	100
67	94
68	98
69	98

70	98
71	98
72	98
73	100
74	100
75	100
76	98
77	100
78	98

[0548]

79	94
80	98
81	98
82	88
83	88
84	81
85	98
86	100
87	98
88	81
90	100
91	94
93	98
94	89
97	98
98	98
101	98

[0549] 在此条件下,当以下化合物的剂量为100ppm时,可观察到良好的(至少70%)或全面的保护:

[0550]

实施例编号	功效%
92	94
95	98
99	100
102	94
103	98
104	100
105	100
106	100

107	100
108	90
109	94
110	83
111	98

[0551] 实施例：小麦壳针孢 (*Septoria tritici*) 的体内预防测试 (小麦叶斑病)

[0552] 被测试的活性成分通过在丙酮/tween/DMSO的混合物中匀质化制得，然后用水稀释以获得所需的活性物质浓缩液。

[0553] 小麦植物 (“Scipion” 种类)，种于50/50泥炭土-火山灰培养基的起始杯中，生长于在22℃下，在1叶阶段 (10cm高) 通过喷洒如上制备的活性成分进行处理。用作对照组的植物用不包含活性物质的丙酮/tween/DMSO/水的混合物进行处理。

[0554] 24小时之后，通过在叶子上喷洒小麦壳针孢孢子 (每毫升500000个) 的水性悬浮液来感染植物。将感染的小麦植物置于18℃、相对湿度、100%的条件下培养72h，然后在相对湿度90%的条件下培养21天。

[0555] 感染24天后，与对照组植物进行对比来进行分级 (功效，%)。

[0556] 在此条件下，当以下化合物的剂量为500ppm时，可观察到良好的 (至少70%) 或全面的保护：

[0557]

实施例编号	功效%
5	93
23	90
24	80
30	70
31	80
32	90
33	90
34	85
35	80
47	80
48	80
49	71
56	80
60	93
64	93
69	71
70	79
72	71
73	71
75	79

78	88
80	86
86	93

[0558]

90	79
93	75
97	79
101	88

[0559] 实施例：凤仙花单囊壳 (*Sphaerotheca fuliginea*) 的体内预防测试 (瓜类白粉病)

[0560] 被测试的活性成分通过在丙酮/tween/DMSO的混合物中匀质化制得,然后用水稀释以获得所需的活性物质浓缩液。

[0561] 小黄瓜植物 (“Vert petit de Paris” 种类), 种于50/50泥炭土-火山灰培养基的起始杯中, 生长于24℃, 在Z11子叶阶段通过喷洒如上制备的活性成分进行处理。用作对照组的植物用不包含活性物质的丙酮/tween/DMSO/水的混合物进行处理。

[0562] 24小时之后, 通过在子叶上喷洒凤仙花单囊壳孢子 (每毫升100000个孢子) 的水性悬浮液来感染植物。孢子收集自被感染的植物。将感染的小黄瓜植物置于20℃、相对湿度70-80%的条件下培养。

[0563] 感染12天后, 与对照组植物进行对比来进行分级 (功效, %)。

[0564] 在此条件下, 当以下化合物的剂量为500ppm时, 可观察到良好的 (至少70%) 或全面的保护:

[0565]

实施例编号	功效%
5	100
6	100
7	78
21	89
23	70
32	98
33	95
34	95
37	100
42	100
45	100
48	100
50	98
53	98
60	100
64	100
69	100

70	100
72	100
73	100
74	98
75	100
77	98

[0566]

78	100
80	98
87	98
90	100
93	98
97	89
98	98
101	100

[0567] 在此条件下,当以下化合物的剂量为100ppm时,可观察到良好的(至少70%)或全面的保护:

[0568]

实施例编号	功效%
92	100
95	100
104	100
105	94
106	89

[0569] 实施例:疣顶单胞锈菌(*Uromyces appendiculatus*)的体内预防测试(豆锈病)

[0570] 被测试的活性成分通过在丙酮/tween/DMSO的混合物中匀质化制得,然后用水稀释以获得所需的活性物质浓缩液。

[0571] 豆植物(“Saxa”种类),种于50/50泥炭土-火山灰培养基的起始杯中,生长于24℃下,在2叶阶段(9cm高)通过喷洒如上制备的活性成分进行处理。用作对照组的植物用不包含活性物质的丙酮/tween/DMSO/水的混合物进行处理。

[0572] 24小时之后,通过在叶子上喷洒疣顶单胞锈菌孢子(每毫升150000个孢子)的水性悬浮液来感染植物。孢子收集自被感染的植物,并且以10%的浓度悬浮在包含25ml/L Tween 80的水中。将感染的豆植物置于20℃、相对湿度100%的条件下培养24h,然后置于20℃、相对湿度70-80%的条件下培养10天。

[0573] 感染10天后,与对照组植物进行对比来进行分级(功效,%)。

[0574] 在此条件下,当以下化合物的剂量为500ppm时,可观察到良好的(至少70%)或全面的保护:

[0575]

实施例编号	功效%
-------	-----

1	100
5	100
6	100
7	100
8	100
11	100
12	96
13	79
14	100
15	100
16	95
17	97
18	76
19	77
20	99
21	100
23	82
26	100
30	100
31	100

[0576]

32	100
33	100
34	100
35	100
36	77
37	100
39	100
40	100
41	100
42	100
43	100
44	100
45	100
46	100
47	86
48	100
49	100
50	100

51	100
52	100
53	100
54	100
55	70
56	86
57	100
58	95
60	100
62	100
64	100
65	95
66	100
67	100
68	100
69	100
70	100
71	99
72	100
73	100
74	100
75	100
76	100
77	100

[0577]

78	100
79	100
80	100
81	99
82	99
83	95
85	99
86	100
87	100
88	100
90	100
91	100
93	100
94	99

97	100
98	100
101	100

[0578] 在此条件下,当以下化合物的剂量为100ppm时,可观察到良好的(至少70%)或全面的保护:

[0579]

实施例编号	功效%
92	100
95	100
99	100
102	100
103	100
104	100
105	100
106	94
107	100
108	100
109	99
110	99
111	100

[0580] 实施例:层锈菌的体内预防测试(大豆)

[0581] 溶剂:24.5重量份的丙酮

[0582] 24.5重量份的二甲基乙酰胺

[0583] 乳化剂:1重量份的烷基芳基聚乙二醇醚

[0584] 为了制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物与上述量的溶剂和乳化剂混合,并将该浓缩液用水稀释到所需浓度。

[0585] 为测试预防活性,用活性化合物的制剂以所述施用率喷洒在幼小植株上。喷洒涂层干燥后,给植物接种大豆锈病(层锈菌(*phakopsora pachyrhizi*))的诱发剂的水性孢子悬浮液,并在在温度为约24℃、相对大气湿度为95%的无光培养室内培养24h。

[0586] 植物在温度为约24℃、相对大气湿度为约80%的无光照培养室内培养12h

[0587] 接种7天后对测试进行评估。0%意指相当于未经处理的对照组的功效,而100%的功效意指未观察到病害。

[0588] 在此实验中,下列的本发明的化合物在10ppm的活性化合物浓度下显示70%或更高的功效。

[0589]

实施例编号	功效%
44	98
46	94
51	93