



(12)发明专利

(10)授权公告号 CN 105705503 B

(45)授权公告日 2019.07.09

(21)申请号 201480059036.5

(22)申请日 2014.08.26

(65)同一申请的已公布的文献号
申请公布号 CN 105705503 A

(43)申请公布日 2016.06.22

(30)优先权数据
13182045.8 2013.08.28 EP

(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2016.04.27

(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/EP2014/068053 2014.08.26

(87)PCT国际申请的公布数据
W02015/028457 EN 2015.03.05

(73)专利权人 拜耳作物科学股份公司
地址 德国莱茵河畔蒙海姆

(72)发明人 S·希勒布兰德 M·瑞德里希
S·霍夫曼 M·J·福特

J·泰尔萨 M·埃斯-塞伊德
G·杭伯格 P·瓦斯内尔
U·瓦赫诺夫-诺伊曼 土屋知己
V·托奎恩

(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 钟守期 曲蕾

(51)Int.Cl.
C07D 417/14(2006.01)
A01N 43/78(2006.01)

(56)对比文件
CN 101970432 A,2011.02.09,
CN 101888843 A,2010.11.17,
CN 101969781 A,2011.02.09,
CN 103180317 A,2013.06.26,
WO 2005082864 A1,2005.09.09,

审查员 姚旻

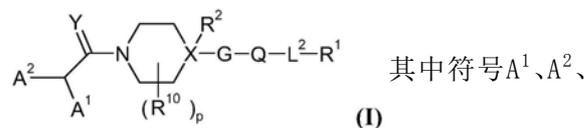
权利要求书3页 说明书100页

(54)发明名称

作为杀真菌剂的杂芳基哌啶和杂芳基哌嗪的丙二酸酯衍生物

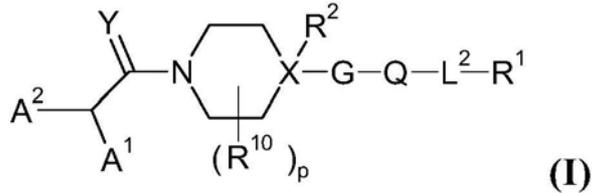
(57)摘要

式(I)的丙二酸酯衍生物以及式(I)化合物的盐、金属络合物和N-氧化物，



Y R¹⁰、p、X、R²、G、Q、L²和R¹各自如说明书中所定义,以及式(I)的丙二酸酯衍生物以及式(I)化合物的盐、金属络合物和N-氧化物用于防治植物致病有害真菌的用途以及制备式(I)化合物的方法。

1. 式 (I) 的化合物以及式 (I) 化合物的盐



其中基团各自定义如下:

A¹是-C(=O)R^{L1},

A²是选自以下基团的杂芳族基团:吡唑-1-基或1,2,4-三唑-1-基,其可含有最多两个取代基,其中取代基相同或不同且各自独立地选自以下基团:

碳上的取代基:

C₁-C₆烷基或C₁-C₆卤代烷基,

Y是氧,

R^{L1}是C₂-C₈烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷氧基或苄氧基,

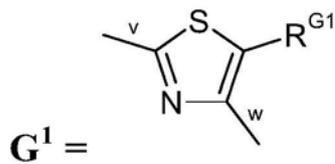
X是碳,

R²是氢,

R¹⁰是氟、甲氧基或羟基,

p是0,

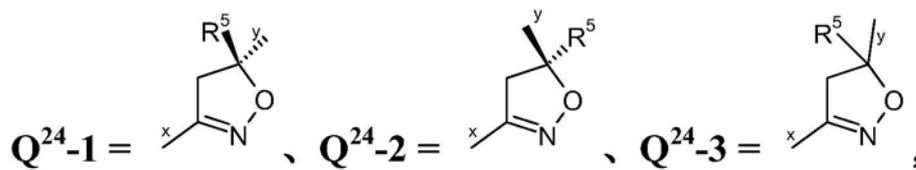
G是G¹



其中以“v”标识的键直接与哌啶环键合,且其中以“w”标识的键直接与Q键合,

R^{G1}是氢,

Q是



其中以“x”标识的键直接与G键合,且其中以“y”标识的键直接与L²键合,

R⁵是氢,

L²是直连键,

R¹是含有1、2或3个取代基的苯基,其中取代基各自独立地至少一次选自Z⁴以及任选地选自以下基团:氟、氯、溴、碘,

Z⁴是甲酰基、C₂-C₆-炔基氧基或C₁-C₆-烷基磺酰基氧基。

2. 权利要求1的式 (I) 的化合物以及式 (I) 化合物的盐,其中

A¹是-C(=O)R^{L1},

A²是选自以下基团的杂芳族基团:吡唑-1-基或1,2,4-三唑-1-基,其可含有最多两个取代基,其中取代基相同或不同且各自独立地选自以下基团:

碳上的取代基：

甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基、1,1-二甲基乙基、氯氟甲基、二氯甲基、二氯氟甲基、二氟甲基、三氯甲基、三氟甲基，

Y是氧，

R^{L1}是乙氧基、正丙氧基、1-甲基乙氧基、正丁氧基、1,1-二甲基乙氧基、1,2-二甲基乙氧基、正戊氧基、正己氧基、正辛氧基、2-乙基己氧基、2-甲氧基乙氧基、2-乙氧基乙氧基，

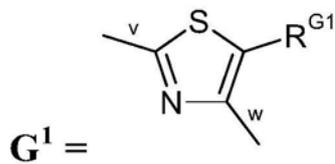
X是碳，

R²是氢，

R¹⁰是氟、甲氧基或羟基，

p是0，

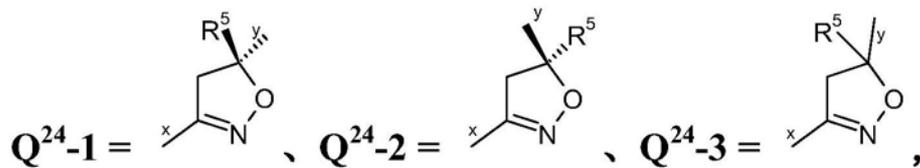
G是G¹



其中以“v”标识的键直接与吡啶环键合，且其中以“w”标识的键直接与Q键合，

R^{G1}是氢，

Q是



其中以“x”标识的键直接与G键合，且其中以“y”标识的键直接与L²键合，

R⁵是氢，

L²是直连键，

R¹是含有1、2或3个取代基的苯基，其中取代基各自独立地至少一次选自Z⁴以及任选地选自以下基团：氟、氯、溴、碘，

Z⁴是甲酰基、丙-2-炔-1-基氧基、丁-2-炔-1-基氧基、戊-2-炔-1-基氧基、甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基。

3. 权利要求1的式(I)的化合物以及式(I)化合物的盐，其中基团定义各自如下：

A¹是-C(=O)R^{L1}，

A²是吡啶-1-基，其含有最多两个取代基，其中取代基各自独立地选自以下基团：甲基、乙基、氯甲基、二氯甲基、氟甲基、二氟甲基或三氟甲基，

Y是氧，

R^{L1}是乙氧基、正丙氧基、1-甲基乙氧基、正丁氧基、1,1-二甲基乙氧基、1,2-二甲基乙氧基、正戊氧基、正己氧基、正辛氧基、2-乙基己氧基、2-甲氧基乙氧基、2-乙氧基乙氧基，

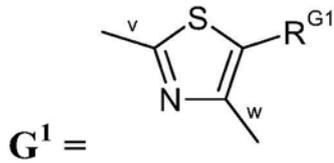
X是碳，

R²是氢，

R¹⁰是氟、甲氧基或羟基，

p是0,

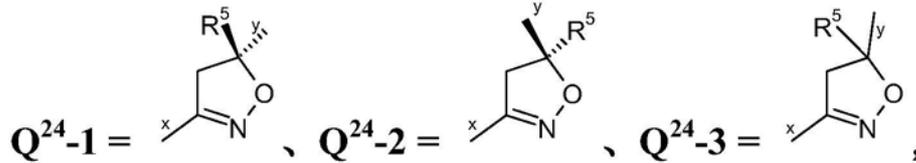
G是G¹



其中以“v”标识的键直接与哌啶环键合,且其中以“w”标识的键直接与Q键合,

R^{G1}是氢,

Q是



其中以“x”标识的键直接与G键合,且其中以“y”标识的键直接与L²键合,

R⁵是氢,

L²是直连键,

R¹是苯基,其被选自以下的取代基取代至少一次:

乙酰基、丙-2-炔-1-基氧基、丁-2-炔-1-基氧基、戊-2-炔-1-基氧基、甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基,

且,另外是未被取代的或被进一步取代的,其中任选的其他取代基选自以下基团:氟、氯。

4. 用于防治植物致病有害真菌的方法,其特征在于,将权利要求1、2或3的式(I)化合物施用于植物致病有害真菌和/或其生境。

5. 用于防治植物致病有害真菌的组合物,其特征在于,含有至少一种权利要求1、2或3的式(I)化合物、以及填充剂和/或表面活性剂。

6. 权利要求1、2或3的式(I)化合物用于防治植物致病有害真菌的用途。

7. 用于制备防治植物致病有害真菌的组合物的方法,其特征在于,将权利要求1、2或3的式(I)化合物与填充剂和/或表面活性剂混合。

8. 权利要求1、2或3的式(I)化合物用于处理转基因植物的用途。

9. 权利要求1、2或3的式(I)化合物用于处理种子的用途。

10. 权利要求1、2或3的式(I)化合物用于处理转基因植物的种子的用途。

作为杀真菌剂的杂芳基哌啶和杂芳基哌嗪的丙二酸酯衍生物

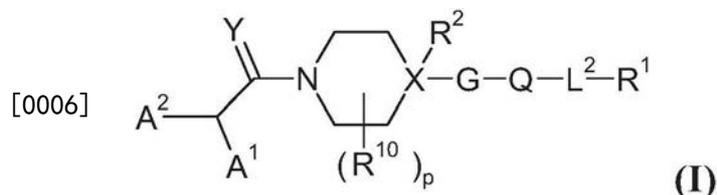
[0001] 本发明涉及杂芳基哌啶和杂芳基哌嗪的丙二酸酯衍生物、涉及其农用化学活性盐、涉及其用途以及用于防治在植物内和/或植物上或植物的种子内和/或植物的种子上的植物致病有害真菌的方法和组合物、涉及制备这类组合物和经处理的种子的方法,以及涉及其用于防治在农业、园艺和林业中、在动物健康、材料保护以及饲养和卫生领域中的植物致病有害真菌的用途。本发明还涉及制备杂芳基哌啶和杂芳基哌嗪的丙二酸酯衍生物的方法。

[0002] 已知特定的杂环取代的哌啶和哌嗪可用作杀真菌作物保护组合物(参见WO 07/014290、WO 08/013925、WO 08/013622、WO 08/091594、WO 08/091580、WO 09/055514、WO 09/094407、WO 09/094445、WO 09/132785、WO 10/037479、WO 10/065579、WO 11/076510、WO 11/018415、WO 11/018401、WO 11/076699、WO 11/134969、WO 11/146182、WO 11/147765、WO 12/020060、WO 12/055837、WO 12/025557、WO 12/082580、WO 12/104273、WO 13/037768、WO 13/098229)。然而,特别在相对低的施用率下,这些化合物的杀真菌功效并不总是充分的。

[0003] 由于对现代作物保护剂的生态学和经济学上的要求不断增长,例如关于活性谱、毒性、选择性、施用率、残留物形成和有利的制备,并且还可能存在例如抗药性问题,因此持续需要开发至少在某些方面优于已知组合物的新的作物保护组合物,尤其是杀真菌剂。

[0004] 现已出人意料地发现,本发明的杂芳基哌啶和杂芳基哌嗪的丙二酸酯衍生物实现了上述目的中的至少一些方面且适合用作作物保护组合物,尤其是用作杀真菌剂。

[0005] 本发明提供式(I)的化合物以及式(I)化合物的盐、金属络合物和N-氧化物



[0007] 其中基团各自定义如下:

[0008] A^1 是氰基、 $-C(=O)R^{L1}$ 或 $-C(=S)R^{L1}$,

[0009] A^2 是氢、卤素、硝基、氰基、烷氧基、卤代烷氧基、 $-NR^3R^4$ 、甲酰基氨基、烷基羰基氨基、卤代烷基羰基氨基、烷硫基、卤代烷硫基、芳基硫基、烷基亚磺酰基、卤代烷基亚磺酰基、芳基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、烷基亚磺酰基氧基、卤代烷基亚磺酰基氧基、芳基亚磺酰基氧基、烷基磺酰基氧基、卤代烷基磺酰基氧基或芳基磺酰基氧基,其中芳基任选被一个、两个或三个独立地选自以下的基团取代:卤素、CN、 NH_2 、 NO_2 、OH、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基或 C_3-C_6 -环烷氧基,或者

[0010] A^2 是任选地苯并稠合的未取代或取代的5元或6元杂芳基,其可含有最多四个取代基,其中碳上的取代基各自独立地选自 Z^{A-1} 且氮上的取代基各自独立地选自 Z^{A-2} ,

[0011] Z^{A-1} 和 R^{G1} 相同或不同,且各自独立地是氢、卤素、羟基、硫醇基、硝基、氰基、 $-C(=O)H$ 、 $-C(=O)OH$ 、烷基、烯基、炔基、卤代烷基、卤代烯基、卤代炔基、环烷基、卤代环烷基、羟基烷基、甲酰基烷基、烷氧基烷基、烷基羰基烷基、烷基环烷基、烷氧基、烷基环烷基烷基、烷

硫基、卤代烷硫基、炔基硫基、烯基氧基、炔基氧基、卤代烷氧基、烷氧基烷氧基、烷基羰基氧基、卤代烷基羰基氧基、环烷基羰基氨基、烷基磺酰基氨基、卤代烷基磺酰基氨基、苯基磺酰基氨基、环烷基烷基、卤代环烷基烷基、环烷基环烷基、烷氧基羰基氧基、烷基羰基硫基、烷基亚磺酰基、卤代烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基、烷基羰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、烷基氨基羰基氧基、 $-C(=O)NR^3R^4$ 或 $-NR^3R^4$,

[0012] Z^{A-2} 相同或不同,且各自独立地是氢、 $-C(=O)H$ 、 $-C(=O)NR^3R^4$ 、烷基、烯基、炔基、卤代烷基、卤代烯基、卤代炔基、环烷基、卤代环烷基、烷基环烷基、环烷基烷基、烷氧基烷基、烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基、环烷基磺酰基、苯基磺酰基、烷基羰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、卤代烷氧基羰基、环烷氧基羰基、苯基或苄基,

[0013] R^3 和 R^4 相同或不同,且各自独立地是氢、烷基、烯基、炔基、卤代烷基、环烷基、苄基或苯基,

[0014] Y 是硫或氧,

[0015] R^{L1} 是氨基、 NR^3R^4 、羟胺基团、烷硫基、卤代烷硫基、烷基羰基氧基、卤代烷基羰基氧基、烷基羰基氨基、卤代烷基羰基氨基、氰基、 C_2-C_{10} -烷氧基、卤代烷氧基、环烷氧基、卤代环烷氧基、烯基氧基、炔基氧基、苯氧基、或苄氧基、或含有一至三个独立地选自O、S和N的杂原子的5元或6元杂环基氧基,条件是所述杂环不含有相邻的氧原子、相邻的硫原子、或相邻的硫和氧原子,其中烷氧基、卤代烷氧基、环烷氧基、卤代环烷氧基、烯基氧基、炔基氧基、烷氧基烷氧基任选被一个或多个独立地选自以下的基团取代:卤素、CN、 NH_2 、 NO_2 、OH、 $=O$ 、 $=S$ 、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基和 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基,且其中苯氧基、苄氧基、杂环基氧基任选被一个或多个独立地选自以下的基团取代:卤素、CN、 NH_2 、 NO_2 、OH、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基或 C_3-C_6 -环烷氧基,

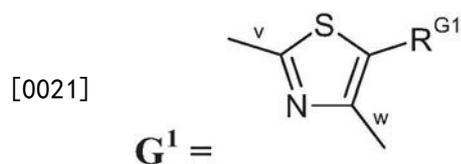
[0016] X 是碳或氮,

[0017] R^2 是氢、烷基、烯基、卤代烷基、烷氧基、卤素、氰基或羟基,

[0018] R^{10} 相同或不同,且独立地是氢、烷基、烯基、卤代烷基、烷氧基、卤素、氰基或羟基,

[0019] p 是0、1或2,

[0020] G 是



[0022] 其中以“v”标识的键直接与哌啶环或哌嗪环键合,且以“w”标识的键直接与Q键合,

[0023] Q 是饱和的或部分不饱和或完全不饱和的5元杂环基,其被通式(I)的 L^2-R^1 取代,且可另外为未取代的或取代的,其中取代基各自独立地选自 R^5 ,

[0024] R^5 相同或不同,且独立地是:

[0025] 与Q的5元杂环基的碳键合的:

[0026] 氧代、硫代、氢、卤素、氰基、羟基、硝基、氨基、 $-CHO$ 、 $-C(=O)OH$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-NR^7R^8$ 、烷基、烯基、炔基、卤代烷基、卤代烯基、卤代炔基、环烷基、卤代环烷基、烷基环烷基、环烷基烷基、环烷基环烷基、卤代环烷基烷基、烷基环烷基烷基、环烯基、卤代环烯基、烷氧

基烷基、环烷氧基烷基、烷氧基烷氧基烷基、烷基硫代烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基、烷基氨基烷基、二烷基氨基烷基、卤代烷基氨基烷基、环烷基氨基烷基、烷基羰基、卤代烷基羰基、环烷基羰基、烷氧基羰基、环烷氧基羰基、环烷基烷氧基羰基、烷基氨基羰基、二烷基氨基羰基、环烷基氨基羰基、卤代烷氧基烷基、羟基烷基、烷氧基、卤代烷氧基、环烷氧基、卤代环烷氧基、环烷基烷氧基、烯基氧基、卤代烯基氧基、炔基氧基、卤代炔基氧基、烷氧基烷氧基、烷基羰基氧基、卤代烷基羰基氧基、环烷基羰基氧基、烷基羰基烷氧基、烷硫基、卤代烷硫基、环烷硫基、烷基亚磺酰基、卤代烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基、环烷基磺酰基、三烷基甲硅烷基、烷基磺酰基氨基、卤代烷基磺酰基氨基，

[0027] 与Q的5元杂环基的氮键合的：

[0028] 氢、烷基、烯基、炔基、卤代烷基、卤代烯基、卤代炔基、环烷基、卤代环烷基、烷基环烷基、环烷基烷基、苯基、苄基、烷基磺酰基、 $-C(=O)H$ 、烷氧基羰基或烷基羰基，

[0029] m 是0、1或2，

[0030] R^7 是氢、烷基、卤代烷基、环烷基、烷基羰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基或卤代烷氧基羰基，

[0031] R^8 是烷基、卤代烷基、环烷基、烷基羰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、卤代烷氧基羰基或 $-L^5R^1$ ，

[0032] L^5 是 $-O-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-S(=O)_m$ 或 CHR^{20} ，

[0033] L^2 是直连键、 $-O-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-S(=O)_m-$ 、 $-CHR^{20}-$ 或 $-NR^{21}-$ ，

[0034] R^{20} 是氢、烷基或卤代烷基，

[0035] R^{21} 是氢、烷基、卤代烷基、环烷基、烷基羰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基或卤代烷氧基羰基，

[0036] R^1 是苯基、苄基、萘基、任选地苯并稠合的取代的5元或6元杂芳基，其被取代基 Z^4 取代至少一次且可另外为未取代的或取代的，其中取代基各自独立地选自 Z^4 以及任选地选自 Z^1 ，或者

[0037] R^1 是5至8元非芳香族(饱和或部分饱和的)碳环，5、6或7元非芳香族杂环基或8至11元碳环或杂环二环，其各自被取代基 Z^4 取代至少一次且可另外为未取代的或取代的，其中取代基各自独立地选自 Z^4 以及任选地选自氧代、硫代或 Z^1 ，

[0038] Z^1 是

[0039] 与 R^1 的碳键合的：

[0040] 氢、卤素、羟基、氨基、硝基、氰基、烷基、烯基、炔基、卤代烷基、卤代烯基、卤代炔基、环烷基、卤代环烷基、羟基烷基、烷氧基烷基、烷基环烷基、烷氧基、烷基环烷基烷基、烷硫基、卤代烷硫基、卤代烷氧基、烷基羰基氧基、烷基氨基、二烷基氨基、环烷基烷基、环烷基环烷基、烷基羰基硫基、烷基亚磺酰基、卤代烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基、烷基羰基、烷氧基羰基、烷基氨基羰基、二烷基氨基羰基、三烷基甲硅烷基和环烷基氨基、环烯基、卤代环烯基、环烷氧基烷基、卤代环烷氧基、环烷硫基、环烷氧基、环烷基烷氧基、环烷基氨基、卤代环烷基烷基、环烷基羰基、环烷基磺酰基或 $-L^3Z^3$ ，

[0041] 与 R^1 的氮键合的：

[0042] 烷基、烷基羰基、烷氧基羰基或烷氧基，

[0043] L^3 是直连键、 $-C(=O)-$ 、硫、氧、 $-NR^{21}-$ 、 $-C(=S)-$ 、 $-S(=O)_m-$ 、 $-CHR^{20}-$ 、 $-CHR^{20}-$

$\text{CHR}^{20}-$ 、 $-\text{CR}^{20}=\text{CR}^{20}-$ 、 $-\text{OCHR}^{20}-$ 、 $-\text{CHR}^{20}\text{O}-$,

[0044] L^4 是 $-\text{C}(=\text{O})\text{O}-$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^3-$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})-$ 、 $-\text{NR}^3\text{C}(=\text{O})-$ 、 $-\text{OCH}_2\text{C}\equiv\text{C}-$ 或 $-\text{OCH}_2\text{CH}=\text{CH}-$,

[0045] Z^3 是苯基、萘基或5或6元杂芳基,其各自可含有0、1、2或3个取代基,其中取代基各自独立地选自以下基团:

[0046] 碳上的取代基:卤素、氰基、硝基、羟基、氨基、 $-\text{SH}$ 、烷基、烯基、炔基、卤代烷基、卤代烯基、卤代炔基、环烷基、卤代环烷基、烷氧基烷基、烷基羰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、烷氧基、卤代烷氧基、环烷氧基、卤代环烷氧基、烯基氧基、炔基氧基、烷氧基烷氧基、烷基氨基、二烷基氨基、烷硫基、卤代烷硫基、烷基亚磺酰基、卤代烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基、三甲硅烷基烷基或苯基,

[0047] 氮上的取代基:氢、 $-\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、烷基、烯基、炔基、卤代烷基、卤代烯基、卤代炔基、环烷基、卤代环烷基、烷基环烷基、环烷基烷基、烷氧基烷基、烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基、环烷基磺酰基、苯基磺酰基、烷基羰基、卤代烷基羰基、烷氧基羰基、卤代烷氧基羰基、环烷氧基羰基、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 、苯基或苄基,

[0048] Z^4 是 $-\text{SH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、卤代烷氧基烷基、烷基硫代烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基氨基烷基、卤代烷基氨基烷基、环烷基氨基烷基、二烷基氨基烷基、烷基磺酰基烷基、烯基氧基、炔基氧基、卤代烯基氧基、卤代炔基氧基、烷氧基烷氧基、卤代烷基羰基氧基、环烷基羰基氧基、烷基磺酰基氨基、卤代烷基磺酰基氨基、烷氧基烷氧基烷基、烷基羰基烷氧基、环烷基氨基羰基、环烷基烷氧基羰基、卤代烷基羰基、环烷氧基羰基、 C_4 - C_6 -烷基羰基、 C_5 - C_6 -烷氧基、 C_5 - C_6 -卤代烷氧基、 C_5 - C_6 -烷硫基、 C_5 - C_6 -卤代烷硫基、 C_5 - C_6 -卤代烷基亚磺酰基、 C_5 - C_6 -卤代烷基磺酰基、氰基烷基、烯基羰基氧基、烷氧基烷硫基、卤代烯基羰基氧基、烷氧基羰基烷基、烷氧基炔基、炔基硫基、卤代环烷基羰基氧基、烯基氨基、炔基氨基、卤代烷基氨基、环烷基烷基氨基、烷氧基氨基、卤代烷氧基氨基、烷基羰基氨基、卤代烷基羰基氨基、烷氧基羰基氨基、烷基羰基(烷基)氨基、卤代烷基羰基(烷基)氨基、烷氧基羰基(烷基)氨基、烯基硫基、卤代烷氧基羰基、烷氧基烷基羰基、 $-\text{SF}_5$ 、卤代烷氧基羰基氨基、二(卤代烷基)氨基烷基、卤代环烯基氧基烷基、烷氧基(烷基)氨基羰基、卤代烷基磺酰基氨基羰基、烷氧基羰基烷氧基、烷基氨基硫代羰基氨基、环烷基烷基氨基烷基、烷基硫代羰基、环烯基氧基烷基、烷氧基烷氧基羰基、二烷基氨基硫代羰基氨基、烷基磺酰基氨基羰基、卤代烷氧基卤代烷氧基、卤代环烷氧基烷基、二烷基氨基羰基氨基、烷氧基烯基、烷氧基卤代烷氧基、烷基硫代羰基氧基、卤代烷氧基烷氧基、卤代烷基磺酰基氧基、烷基磺酰基氧基、烷氧基卤代烷基、二(卤代烷基)氨基、二烷氧基烷基、烷基氨基羰基氨基、卤代烷氧基卤代烷基、烷基氨基羰基烷基氨基、三烷基甲硅烷基炔基氧基、三烷基甲硅烷基氧基、三烷基甲硅烷基炔基、氰基(烷氧基)烷基、二烷基硫代烷基、烷氧基磺酰基、环烷基亚磺酰基、卤代环烷氧基羰基、烷基环烷基羰基、卤代环烷基羰基、烯基氧基羰基、炔基氧基羰基、氰基烷氧基羰基、烷基硫代烷氧基羰基、炔基羰基氧基、卤代炔基羰基氧基、氰基羰基氧基、氰基烷基羰基氧基、环烷基磺酰基氧基、环烷基烷基磺酰基氧基、卤代环烷基磺酰基氧基、烯基磺酰基氧基、炔基磺酰基氧基、氰基烷基磺酰基氧基、卤代烯基磺酰基氧基、卤代炔基磺酰基氧基、炔基环烷基氧基、氰基烯基氧基、氰基炔基氧基、烷氧基羰基氧基、烯基氧基羰基氧基、炔基氧基羰基氧基、烷氧基烷基羰基氧基、 $-\text{O}(\text{C}=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{SCN}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{O})\text{H}$ 、 $-\text{C}(=\text{NOR}^9)\text{R}^{13}$ 、 $-\text{NR}^{12}\text{SO}_2\text{Z}^3$ 、 $-\text{O}(\text{C}=\text{S})$

$\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{O}(\text{C}=\text{S})\text{SR}^6$ 、 $-\text{N}=\text{C}(\text{R}^6)_2$ 、 $-\text{OSO}_2\text{Z}^3$ 、 $-\text{NHCN}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NHCN}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(=\text{S})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NHCN}$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 或 $-\text{L}^4\text{Z}^3$,或者

[0049] Z^4 是含有1或2个取代基的烷基,其中取代基各自独立地选自以下基团:

[0050] 氰基、烷氧基羰基、 $-\text{C}(=\text{N}-\text{R}^6)\text{R}^{13}$ 、 $-\text{C}(=\text{N}-\text{NR}^3\text{R}^4)\text{R}^{13}$ 、烷基羰基氨基、卤代烷基羰基氨基、二烷基羰基氨基、烷基羰基氧基、 $-\text{C}(=\text{O})\text{H}$ 、苄氧基、苯甲酰氧基、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、烯基氧基、炔基氧基、卤代烯基氧基、卤代炔基氧基、卤代环烷氧基、烷氧基氨基、烯基硫基、炔基硫基、环烷硫基、卤代烷氧基氨基、卤代烷硫基、烯基亚磺酰基、炔基亚磺酰基、环烷基亚磺酰基、卤代烷基亚磺酰基、烯基磺酰基、炔基磺酰基、环烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基、烷氧基羰基氧基、烷基羰基氧基、环烷基羰基氧基、卤代烷基羰基氧基、卤代烯基羰基氧基、 $-\text{SCN}$ 、烷基氨基羰基氧基、烷基羰基(烷基)氨基、烷氧基羰基(烷基)氨基、烷基氨基羰基氨基、烷基磺酰基氧基、卤代烷氧基羰基氨基、卤代烷基羰基(烷基)氨基、卤代烷基磺酰基氧基、烷基磺酰基氨基、卤代烷基磺酰基氨基、烷基硫代羰基氧基、氰基烷氧基、环烷基烷氧基、苄氧基烷氧基、烷氧基卤代烷氧基、烷氧基烷硫基、烷氧基烷基亚磺酰基、烷氧基烷基磺酰基、烷氧基烷基羰基氧基、环烷氧基烷氧基、卤代烷氧基烷氧基、卤代烷氧基卤代烷氧基、烷氧基羰基烷氧基、烷基羰基烷氧基、烷硫基烷氧基、二烷基氨基羰基氨基、烷氧基烷氧基、三烷基甲硅烷基氧基、三烷基甲硅烷基炔基氧基、炔基环烷基氧基、环烷基炔基氧基、烷氧基羰基炔基氧基、芳基炔基氧基、烷基氨基羰基炔基氧基、二烷基氨基羰基炔基氧基、烯基羰基氧基、炔基羰基氧基、卤代炔基羰基氧基、氰基烷基羰基氧基、环烷基磺酰基氧基、环烷基烷基磺酰基氧基、卤代环烷基磺酰基氧基、烯基磺酰基氧基、炔基磺酰基氧基、氰基烷基磺酰基氧基、卤代烯基磺酰基氧基、卤代炔基磺酰基氧基、二烷基氨基羰基氧基、卤代烷基氨基羰基氧基、 N -烷基- N -卤代烷基氨基羰基氧基、烯基氧基羰基、炔基氧基羰基、卤代炔基氧基羰基、氰基烷基氧基羰基、烯基氧基磺酰基、炔基氧基磺酰基,或者

[0051] Z^4 是含有1或2个取代基的烯基,其中取代基各自独立地选自以下基团:

[0052] 三烷基甲硅烷基、环烷基、亚环丙基、烷氧基、三烷基甲硅烷基氧基、烷基羰基氧基,或者

[0053] Z^4 是含有1或2个取代基的炔基,其中取代基各自独立地选自以下基团:

[0054] 环烷基、亚环丙基,或者

[0055] Z^4 是含有1或2个取代基的烷氧基,其中取代基各自独立地选自以下基团:

[0056] 烷氧基羰基、环烷氧基、烷基羰基氧基、 $-\text{O}(\text{C}=\text{O})\text{H}$ 、烷硫基、羟基烷基、三烷基甲硅烷基、环烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基、苄氧基、烷氧基烷氧基、烷基磺酰基、氰基,或者

[0057] Z^4 是含有1或2个取代基的烯基氧基,其中取代基各自独立地选自以下基团:

[0058] 环烷基、羟基、烷氧基、烯基氧基、炔基氧基、卤代烷氧基、卤代烯基氧基、卤代炔基氧基、环烷氧基、环卤代烷氧基、烷氧基羰基、卤代烷氧基羰基、环烷氧基羰基、烯基氧基羰基、卤代烯基氧基羰基、炔基氧基羰基、卤代炔基氧基羰基、烷基羰基、卤代烷基羰基、环烷基羰基、环卤代烷基羰基、烯基羰基、卤代烯基羰基、炔基羰基、卤代炔基羰基,或者

[0059] Z^4 是含有1或2个取代基的炔基氧基,其中取代基各自独立地选自以下基团:

[0060] 环烷基、烷氧基羰基、 $-\text{Z}^3$ 、烷基氨基羰基、二烷基氨基羰基,

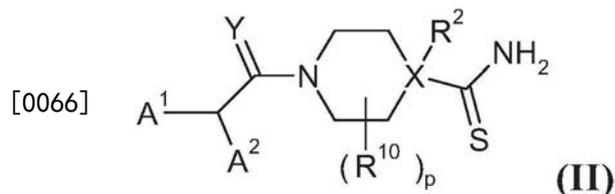
[0061] R^6 是烷基、烯基、炔基、卤代烷基、环烷基、苄基或苯基,

[0062] R^9 是氢、烷基、卤代烷基、苄基或 Z^3 ,

[0063] R^{13} 是氢、烷基、卤代烷基、环烷基烷基、环烷基、烷基环烷基、卤代烷基环烷基、烷氧基烷基、卤代烷氧基烷基、苄基或苯基，

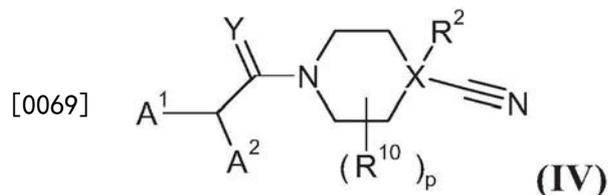
[0064] R^{11} 和 R^{12} 相同或不同，且各自独立地是氢、烷基、烯基、炔基、卤代烷基、环烷基、烷氧基烷基、氰基烷基、甲酰基、烷基羰基、环烷氧基羰基、烷氧基羰基、烯基氧基羰基、炔基氧基羰基、卤代烷基羰基、卤代环烷基羰基、环烷氧基羰基、环烷基羰基、二烷基氨基羰基、二烷基氨基硫代羰基、苄基或苯基。

[0065] 本发明还提供式 (II) 的化合物以及式 (II) 化合物的盐、金属络合物和N-氧化物



[0067] 其中基团 A^1 、 A^2 、X、Y、 R^{10} 、 R^2 和p如式 (I) 所定义。

[0068] 本发明还提供式 (IV) 的化合物以及式 (IV) 化合物的盐、金属络合物和N-氧化物



[0070] 其中基团 A^1 、 A^2 、X、Y、 R^{10} 、 R^2 和p如式 (I) 所定义。

[0071] 本发明还提供式 (I) 化合物作为杀真菌剂的用途。

[0072] 本发明的式 (I) 的杂芳基哌啶和杂芳基哌嗪的丙二酸酯衍生物及其盐、金属络合物和N-氧化物非常适于防治植物致病有害真菌。上述本发明的化合物特别地表现出有效的杀真菌活性并且能够用在作物保护、饲养和卫生领域以及用在材料保护中。

[0073] 式 (I) 的化合物可以纯物质形式存在或以不同的可能的异构体形式的混合物存在，所述异构体形式尤其是立体异构体，如E和Z、苏式和赤式，以及光学异构体，如R和S异构体或阻转异构体，如果合适，还可以是互变异构体。E和Z异构体、苏式和赤式异构体以及光学异构体、任何想要的这些异构体的混合物以及可能的互变异构形式均是本发明所要求保护的。

[0074] 本发明式 (I) 化合物的基团定义具有如下优选的、更优选的和最优选的定义：

[0075] A^1 优选是氰基或 $-C(=O)R^{L1}$ ，且更优选 $-C(=O)R^{L1}$ ，

[0076] A^2 优选是氢、卤素、烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基、芳基磺酰基、烷基磺酰基氧基、卤代烷基磺酰基氧基或芳基磺酰基氧基，其中芳基任选被一个、两个或三个独立地选自以下的基团取代：卤素、CN、 NH_2 、 NO_2 、OH、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基或 C_3-C_6 -环烷氧基，或者

[0077] A^2 优选是选自以下基团的杂芳族基团：呋喃-2-基、呋喃-3-基、噁吩-2-基、噁吩-3-基、异噁唑-3-基、异噁唑-4-基、异噁唑-5-基、吡咯-1-基、吡咯-2-基、吡咯-3-基、噁唑-2-基、噁唑-4-基、噁唑-5-基、噁唑-2-基、噁唑-4-基、噁唑-5-基、异噁唑-3-基、异噁唑-4-基、异噁唑-5-基、吡唑-1-基、吡唑-3-基、吡唑-4-基、咪唑-1-基、咪唑-2-基、咪唑-4-基、1,2,3-三唑-1-基、1,2,4-三唑-1-基、吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、哒嗪-3-基、哒嗪-4-

基、吡嗪-2-基、吡嗪-3-基、嘧啶-2-基、嘧啶-4-基或嘧啶-5-基,其可含有最多两个取代基,其中取代基各自独立地选自以下基团:

[0078] 碳上的取代基:

[0079] 卤素、氰基、羟基、硝基、 $-NR^3R^4$ 、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_2-C_6 -卤代烯基、 C_2-C_6 -卤代炔基、 C_3-C_6 -卤代环烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、羟基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_6 -烷基羰基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基、 C_1-C_6 -烷基羰基氧基或苯基,

[0080] 氮上的取代基:

[0081] C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_2-C_6 -卤代烯基、 C_2-C_6 -卤代炔基、 C_3-C_{10} -环烷基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基羰基、苯基、苄基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基、苯基磺酰基、 $-C(=O)H$ 或 C_1-C_6 -烷基羰基,

[0082] A^2 更优选是氢、氯、溴、碘、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基、苯基磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基氧基或苯基磺酰基氧基,其中苯基任选被一个、两个或三个独立地选自以下的基团取代:卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基或 C_1-C_4 -卤代烷氧基,或者

[0083] A^2 更优选是选自以下基团的杂芳族基团:呋喃-2-基、呋喃-3-基、噁吩-2-基、噁吩-3-基、异噁唑-3-基、异噁唑-4-基、异噁唑-5-基、吡咯-1-基、吡咯-2-基、吡咯-3-基、噁唑-2-基、噁唑-4-基、噁唑-5-基、噻唑-2-基、噻唑-4-基、噻唑-5-基、异噻唑-3-基、异噻唑-4-基、异噻唑-5-基、吡啶-1-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、咪唑-1-基、咪唑-2-基、咪唑-4-基、1,2,3-三唑-1-基、1,2,4-三唑-1-基、吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、哒嗪-3-基、哒嗪-4-基、嘧啶-2-基、嘧啶-4-基或嘧啶-5-基,其可含有最多两个取代基,其中取代基相同或不同且各自独立地选自以下基团:

[0084] 碳上的取代基:

[0085] 氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基、1,1-二甲基乙基、氯氟甲基、二氯甲基、二氯氟甲基、二氟甲基、三氯甲基、三氟甲基、环丙基、乙氧基、1-甲基乙氧基、正丙氧基、甲氧基、三氟甲氧基、二氟甲氧基、1-甲基乙基硫基、甲基硫基、乙基硫基、正丙基硫基、二氟甲基硫基、三氟甲基硫基或苯基,

[0086] 氮上的取代基:

[0087] 甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基、甲基磺酰基、三氟甲基磺酰基、甲基羰基、三氟甲基羰基、氯甲基羰基、2,2-三氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2-氯-2-二氟乙基或2-氯-2-氟乙基,

[0088] A^2 最优选是氢、氯、溴、碘、甲基磺酰基氧基、三氟甲基磺酰基氧基、苯基磺酰基氧基或4-甲基苯基磺酰基氧基,或者

[0089] A^2 最优选是吡啶-1-基,其可含有最多两个取代基,其中取代基各自独立地选自以下基团:甲基、乙基、氯、氯甲基、二氯甲基、溴、氟、氟甲基、二氟甲基或三氟甲基,

[0090] R^3 和 R^4 优选相同或不同,且各自独立地是氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_3-C_8 -环烷基、苄基或苯基,且更优选是氢、甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基、正丁基或1,1-二甲基乙基,

[0091] Y 优选是硫或氧,且更优选是氧,

[0092] R^{L1} 优选是氨基、 NR^3R^4 、羟胺基团、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -烷基羰基氧基、 C_1-C_4 -卤代烷基羰基氧基、 C_1-C_4 -烷基羰基氨基、 C_1-C_4 -卤代烷基羰基氨基、氰基、 C_2-C_8 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷氧基、 C_2-C_6 -烯基氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷氧基、苯氧基或苄氧基,其中苯氧基、苄氧基任选被一个或两个独立地选自以下的取代基取代:卤素、CN、OH、甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基、正丁基、2,2,2-三氟甲基、二氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基,且更优选是氨基、乙氧基、正丙氧基、1-甲基乙氧基、正丁氧基、1,1-二甲基乙氧基、1,2-二甲基乙氧基、正戊氧基、正己氧基、正辛氧基、2-乙基己氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-甲氧基乙氧基、2-乙氧基乙氧基、烯丙氧基、丁-2-烯-1-基氧基、丙-2-炔-1-基氧基、苯氧基、2,6-二甲基苯氧基、2,6-二异丙基苯氧基、2,6-二-叔丁基苯氧基、苄氧基、4-甲氧基苄氧基或3,4-二甲氧基苄氧基,

[0093] X 优选是碳或氮,且更优选是碳,

[0094] R^2 优选是氢、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_2 -卤代烷基、 C_1-C_2 -烷氧基、卤素、氰基或羟基,且更优选是氢、氟、甲氧基或羟基,且最优选是氢,

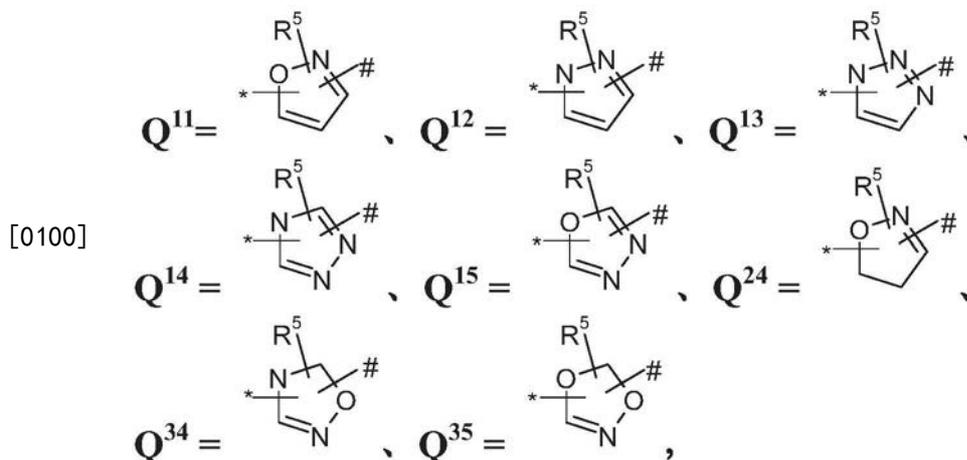
[0095] R^{10} 优选相同或不同,且独立地是氢、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_2 -卤代烷基、 C_1-C_2 -烷氧基、卤素、氰基或羟基,且更优选是氢、氟、甲氧基或羟基,

[0096] p 优选是0或1,且更优选是0,

[0097] G 优选是 G^1

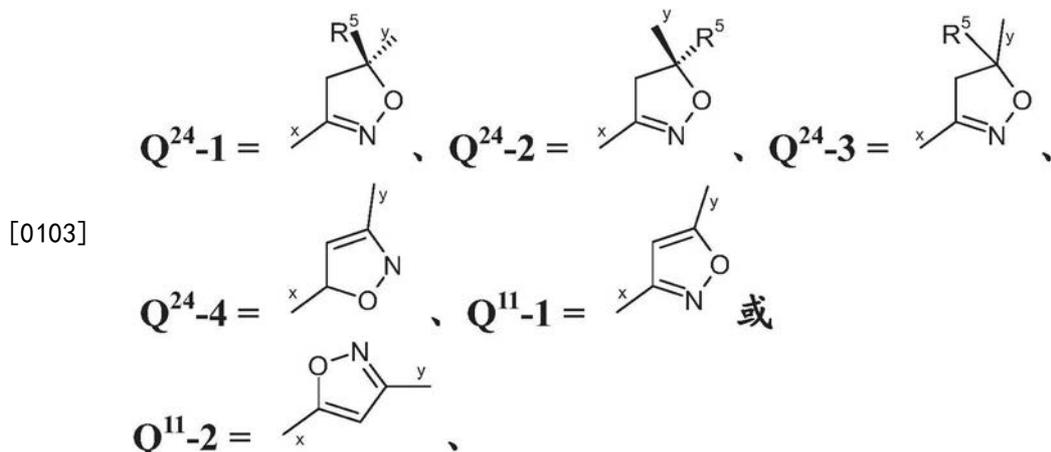
[0098] R^{G1} 优选是氢、 C_1-C_3 -烷基或卤素,且更优选是氢,

[0099] Q 优选是



[0101] 其中以“*”标识的键直接与G或 L^2 键合,且以“#”标识的键直接与 L^2 或G键合,或其中以“*”标识的键直接与 L^2 键合,且同时以“#”标识的键直接与G键合,

[0102] Q 更优选是



[0104] 其中以“x”标识的键直接与G键合,且其中以“y”标识的键直接与L²键合,

[0105] R⁵ 优选相同或不同,且独立地是

[0106] 与Q的5元杂环基的碳键合的:

[0107] 氢、卤素、氰基、-NR⁷R⁸、C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₁-C₆-卤代烷基、C₂-C₆-卤代烯基、C₂-C₆-卤代炔基、C₃-C₈-环烷基、C₃-C₈-卤代环烷基、C₃-C₈-卤代环烷基、C₁-C₄-烷基-C₃-C₈-环烷基、C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₃-C₈-环烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷氧基、C₃-C₈-环烷氧基、C₃-C₈-卤代环烷氧基、C₃-C₈-环烷基-C₁-C₄-烷氧基、C₂-C₆-烯基氧基、C₂-C₆-卤代烯基氧基、C₂-C₆-炔基氧基、C₂-C₆-卤代炔基氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₆-烷基羰基氧基、C₁-C₆-卤代烷基羰基氧基、C₃-C₈-环烷基羰基氧基、C₁-C₆-烷基羰基-C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-烷硫基、C₁-C₆-卤代烷硫基、C₃-C₈-环烷硫基、三(C₁-C₄-烷基)甲硅烷基,

[0108] 与Q的5元杂环基的氮键合的:

[0109] 氢、-C(=O)H、C₁-C₃-烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基或苄基,

[0110] R⁵ 更优选是氢、氰基、甲基、三氟甲基、二氟甲基或甲氧基甲基,或者

[0111] R⁵ 最优选是氢,

[0112] R⁷ 优选是氢、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₃-C₈-环烷基、C₁-C₄-烷基羰基、C₁-C₄-卤代烷基羰基、C₁-C₄-烷氧基羰基或C₁-C₄-卤代烷氧基羰基,

[0113] R⁸ 优选是C₁-C₃-烷基或-L⁵R¹,

[0114] L⁵ 优选是-C(=O)-或S(=O)₂,

[0115] L² 优选是直连键、-O-、-C(=O)-、-S(=O)₂-、-CHR²⁰-或-NR²¹- ,且更优选是直连键、-C(=O)-、-CHR²⁰-或-NR²¹- ,且最优选是直连键,

[0116] R²⁰ 优选是氢、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-卤代烷基,且更优选是氢、甲基、乙基、三氟甲基,

[0117] R²¹ 优选是氢、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-卤代烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-卤代烷基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基或C₁-C₆-卤代烷氧基羰基,且更优选是氢或甲基,

[0118] R¹ 优选是C₅-C₆-环烯基或C₃-C₈-环烷基,其中C₅-C₆-环烯基或C₃-C₈-环烷基各自被取代基Z⁴取代至少一次并可另外为未取代的或取代的,其中取代基各自独立地选自Z⁴以及任选地选自Z¹⁻¹,且更优选是取代的环戊烯基、环己烯基、环戊基、环己基或环庚基,其各自可含有1或2个取代基,其中取代基各自独立地至少一次选自Z⁴以及任选地选自以下基团:

甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、三氟甲氧基、乙炔基、2-丙烯基氧基、2-丙炔基氧基、甲基羰基氧基、乙基羰基氧基、三氟羰基氧基、甲基硫基、乙基硫基或三氟甲基硫基,或者

[0119] R^1 优选是苯基,其被取代基 Z^4 取代至少一次并可另外为未取代的或取代的,其中取代基各自独立地选自 Z^4 以及任选地选自 Z^{1-2} ,且更优选是可含有1、2或3个取代基的苯基,其中取代基各自独立地至少一次选自 Z^4 以及任选地选自以下基团:氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、羟基、氨基、-SH、-C(=O)H、甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基、正丁基、1,1-二甲基乙基、1,2-二甲基乙基、乙烯基、乙炔基、三氟甲基、二氟甲基、三氯甲基、二氯甲基、环丙基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、1-甲基乙氧基、1,1-二甲基乙氧基、甲基羰基、乙基羰基、三氟甲基羰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正丙氧基羰基、1-甲基乙氧基羰基、1,1-二甲基乙氧基羰基、1-乙烯基氧基、2-丙烯基氧基、2-丙炔基氧基、甲基羰基氧基、三氟甲基羰基氧基、氯甲基羰基氧基、甲基硫基、乙基硫基、甲基磺酰基或 $-L^3Z^3$,且最优选是被选自以下的取代基取代至少一次的苯基:

[0120] 甲酰基、甲氧基甲氧基、2-甲氧基乙氧基、烯丙氧基、2-氟丙-2-烯-1-基氧基、2-氯丙-2-烯-1-基氧基、3-氯丙-2-烯-1-基氧基、2-溴丙-2-烯-1-基氧基、2-甲基丙-2-烯-1-基氧基、3,3-二氯丙-2-烯-1-基氧基、3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基氧基、丁-2-烯-1-基氧基、丁-3-烯-2-基氧基、丁-3-烯-1-基氧基、3-氯丁-2-烯-1-基氧基、3-甲基丁-2-烯-1-基氧基、4,4,4-三氟丁-2-烯-1-基氧基、丙-2-炔-1-基氧基、3-氯丙-2-炔-1-基氧基、3-溴丙-2-炔-1-基氧基、丁-2-炔-1-基氧基、戊-2-炔-1-基氧基、2-氟-2-甲基丙酰氧基、3,3,3-三氟丙酰氧基、环丙基羰基氧基、环己基羰基氧基、(1-氯环丙基)羰基氧基、丁-2-烯酰氧基、丙烯酰氧基、苯甲酰氧基、2-氟苯甲酰氧基、3-氟苯甲酰氧基、4-氟苯甲酰氧基、氰基甲氧基、甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基、三氟甲基磺酰基氧基、环丙基磺酰基氧基、2-甲氧基乙氧基甲基、烯丙氧基甲基、丙-2-炔-1-基氧基甲基、甲基磺酰基甲基、甲基羰基氨基甲基、甲基磺酰基氨基甲基、-C(=NOH)H、-C(=NOCH₃)H、-C(=NOCH₂CH₃)H、-C(=NOCH(CH₃)CH₃)H、-C(=NOH)CH₃、-C(=NOCH₃)CH₃、-C(=NOCH₂CH₃)CH₃、-C(=NOCH(CH₃)CH₃)CH₃、二甲基氨基磺酰基、-C(=O)NH₂、乙基氨基磺酰基、三甲基甲硅烷基乙炔基、二乙基氨基磺酰基、甲基氨基磺酰基、三甲基甲硅烷基氧基、三甲基甲硅烷基丙-2-炔-1-基氧基、三氟甲基氨基、二甲基氨基羰基氨基、-C(=O)OH、1,1-二甲基乙基羰基氨基、氯甲基羰基氨基、三氟甲基羰基氨基、1,1-二甲基乙氧基羰基氨基、乙基羰基氨基、1-甲基乙氧基羰基氨基、三氟甲基羰基氨基、甲基羰基氨基、甲氧基羰基氨基、乙氧基羰基氨基、异丙氧基羰基氨基、1-甲基乙基羰基氨基、甲基磺酰基氨基或苯基磺酰基氨基、3-溴丙-2-烯-1-基氧基,

[0121] 且其他取代基任选地选自以下基团:氟、氯、甲基、三氟甲基、甲氧基,

[0122] R^1 优选是萘-1-基、萘-2-基、1,2,3,4-四氢萘-1-基、1,2,3,4-四氢萘-2-基、5,6,7,8-四氢萘-1-基、5,6,7,8-四氢萘-2-基、萘烷-1-基、萘烷-2-基、1H-茛-1-基、2,3-二氢-1H-茛-1-基、1H-茛-2-基、1H-茛-3-基、1H-茛-4-基、1H-茛-5-基、1H-茛-6-基、1H-茛-7-基、茛满-1-基、茛满-2-基、茛满-3-基、茛满-4-基或茛满-5-基,

[0123] 其中这些基团各自被取代基 Z^4 取代至少一次并可另外为未取代的或取代的,其中取代基各自独立地选自 Z^4 以及任选地选自 Z^{1-3} ,

[0124] R^1 更优选是萘-1-基、萘-2-基、1,2,3,4-四氢萘-1-基、1,2,3,4-四氢萘-2-基、5,6,7,8-四氢萘-1-基、5,6,7,8-四氢萘-2-基、萘烷-1-基、萘烷-2-基、1H-茛-1-基、2,3-二

氢-1H-茛-1-基、1H-茛-2-基、1H-茛-3-基、1H-茛-4-基、1H-茛-5-基、1H-茛-6-基、1H-茛-7-基、茛满-1-基、茛满-2-基、茛满-3-基、茛满-4-基或茛满-5-基，其中这些基团各自被取代基 Z^4 取代至少一次并可另外含有其他的各自独立地选自 Z^4 以及任选地选自以下基团的取代基：甲基、甲氧基、氰基、氟、氯、溴和碘，其中在特别优选的变体中最多共存在三个取代基，

[0125] R^1 优选是5或6元杂芳基，其被取代基 Z^4 取代至少一次并可另外为未取代的或取代的，其中碳上的取代基各自独立地选自 Z^4 以及任选地选自 Z^{1-4} ，且氮上的取代基各自独立地选自 Z^2 ，

[0126] R^1 更优选是呋喃-2-基、呋喃-3-基、噻吩-2-基、噻吩-3-基、异噁唑-3-基、异噁唑-4-基、异噁唑-5-基、吡咯-1-基、吡咯-2-基、吡咯-3-基、噁唑-2-基、噁唑-4-基、噁唑-5-基、噻唑-2-基、噻唑-4-基、噻唑-5-基、异噻唑-3-基、异噻唑-4-基、异噻唑-5-基、吡啶-1-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、咪唑-1-基、咪唑-2-基、咪唑-4-基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,3,4-噁二唑-2-基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,3,4-噁二唑-2-基、1,2,3-三唑-1-基、1,2,3-三唑-2-基、1,2,3-三唑-4-基、1,2,4-三唑-1-基、1,2,4-三唑-3-基、1,2,4-三唑-4-基、吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、哒嗪-3-基、哒嗪-4-基、嘧啶-2-基、嘧啶-4-基、嘧啶-5-基或吡嗪-2-基，其各自可含有1或2个取代基，其中取代基各自独立地至少一次选自 Z^4 并可另外为未取代的或取代的，其中取代基各自独立地选自 Z^4 以及任选地选自以下基团：

[0127] 碳上的取代基：氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、羟基、氨基、甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基、正丁基、1,1-二甲基乙基、1,2-二甲基乙基、乙烯基、乙炔基、三氟甲基、二氟甲基、三氯甲基、二氯甲基、环丙基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、1-甲基乙氧基、1,1-二甲基乙氧基、甲基羰基、乙基羰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正丙氧基羰基、1-甲基乙氧基羰基、1,1-二甲基乙氧基羰基、甲基羰基氧基、甲基硫基、乙基硫基或甲基磺酰基，

[0128] 氮上的取代基：甲基、乙基、正丙基、 $-C(=O)H$ 、甲基羰基、三氟甲基羰基、氯甲基羰基、甲基磺酰基、三氟甲基磺酰基、苯基磺酰基、苯基或2-丙炔基，或者

[0129] R^1 优选是苯并稠合的取代的5或6元杂芳基，其被至少一个取代基 Z^4 取代并可另外为未取代的或取代的，其中碳上的取代基各自独立地选自 Z^4 和 Z^{1-5} ，且氮上的取代基各自独立地选自 Z^2 ，且更优选是吡啶-1-基、吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、吡啶-5-基、吡啶-6-基、吡啶-7-基、苯并咪唑-1-基、苯并咪唑-2-基、苯并咪唑-4-基、苯并咪唑-5-基、吡啶-1-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、吡啶-5-基、吡啶-6-基、吡啶-7-基、吡啶-2-基、1-苯并呋喃-2-基、1-苯并呋喃-3-基、1-苯并呋喃-4-基、1-苯并呋喃-5-基、1-苯并呋喃-6-基、1-苯并呋喃-7-基、1-苯并噻吩-2-基、1-苯并噻吩-3-基、1-苯并噻吩-4-基、1-苯并噻吩-5-基、1-苯并噻吩-6-基、1-苯并噻吩-7-基、1,3-苯并噻唑-2-基、1,3-苯并噻唑-4-基、1,3-苯并噻唑-5-基、1,3-苯并噻唑-6-基、1,3-苯并噻唑-7-基、1,3-苯并噁唑-2-基、1,3-苯并噁唑-4-基、1,3-苯并噁唑-5-基、1,3-苯并噁唑-6-基、1,3-苯并噁唑-7-基、喹啉-2-基、喹啉-3-基、喹啉-4-基、喹啉-5-基、喹啉-6-基、喹啉-7-基、喹啉-8-基、异喹啉-1-基、异喹啉-3-基、异喹啉-4-基、异喹啉-5-基、异喹啉-6-基、异喹啉-7-基或异喹啉-8-基，其各自被取代基 Z^4 取代至少一次并可另外为未取代的或取代的，其中取代基各自独立地选自 Z^4 以及任选地选自以下基团：

[0130] 碳上的取代基：氟、氯、溴、碘、甲基、甲氧基，

[0131] 氮上的取代基: 甲基、乙基、正丙基、 $-C(=O)H$ 、甲基羰基、三氟甲基羰基、氯甲基羰基、甲基磺酰基、三氟甲基磺酰基、苯基磺酰基、苯基或2-丙炔基, 或者

[0132] R^1 优选是 C_5-C_{15} -杂环基, 其被取代基 Z^4 在碳上取代至少一次并可另外为未取代的或取代的, 其中碳上的取代基各自独立地选自 Z^4 、氧代、硫代或 Z^{1-6} , 且氮上的取代基各自独立地选自 Z^2 ,

[0133] R^1 更优选是哌啶-1-基、哌啶-2-基、哌啶-3-基、哌啶-4-基、哌嗪-1-基、哌嗪-2-基、哌嗪-3-基、吗啉-1-基、吗啉-2-基、吗啉-3-基、四氢吡喃-2-基、四氢吡喃-3-基、四氢吡喃-4-基、1,2,3,4-四氢喹啉-1-基、1,2,3,4-四氢异喹啉-2-基、1,2,3,4-四氢喹啉-1-基、吡啶-1-基、异吡啶-2-基、十氢喹啉-1-基或十氢异喹啉-2-基, 其各自被取代基 Z^4 取代至少一次并可另外为未取代的或取代的, 其中取代基各自独立地选自 Z^4 以及任选地选自以下基团:

[0134] 碳上的取代基: 氟、氯、溴、碘、甲基、甲氧基、氧代、硫代,

[0135] 氮上的取代基: 甲基、乙基、正丙基、 $-C(=O)H$ 、甲基羰基、三氟甲基羰基、氯甲基羰基、甲基磺酰基、三氟甲基磺酰基、苯基磺酰基、苯基或2-丙炔基,

[0136] Z^{1-1} 相同或不同, 且各自独立地是氢、氰基、卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -卤代烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_2-C_6 -卤代炔基、羟基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_1-C_6 -烷基羰基氧基、 C_1-C_6 -烷硫基或 C_1-C_6 -卤代烷硫基,

[0137] Z^{1-2} 是氢、卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_2-C_6 -卤代烯基、 C_2-C_6 -卤代炔基、 C_3-C_8 -环烷基、 C_3-C_8 -卤代环烷基、 C_3-C_8 -环烯基、 C_3-C_8 -卤代环烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷基羰基、 C_3-C_8 -环烷基羰基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_3-C_8 -环烷氧基、 C_3-C_8 -卤代环烷氧基、 C_1-C_6 -烷基羰基氧基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_1-C_6 -卤代烷硫基、 C_3-C_6 -环烷硫基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基、 C_1-C_6 -卤代烷基磺酰基、 C_3-C_8 -环烷基磺酰基、三(C_1-C_4 -烷基)甲硅烷基或 $-L^3Z^3$,

[0138] Z^{1-3} 和 Z^{1-5} 相同或不同, 且各自独立地是氢、卤素、氰基、硝基、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_2-C_6 -卤代烯基、 C_2-C_6 -卤代炔基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_6 -烷基羰基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_6 -烷基羰基氧基、 C_1-C_6 -烷基羰基硫基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -卤代烷硫基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基或 C_1-C_4 -卤代烷基磺酰基,

[0139] Z^{1-4} 是氢、卤素、氰基、羟基、氨基、硝基、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_2-C_6 -卤代烯基、 C_2-C_6 -卤代炔基、 C_3-C_8 -环烷基、 C_3-C_8 -卤代环烷基、 C_3-C_8 -环烯基、 C_3-C_8 -卤代环烯基、 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -烷基羰基、 C_3-C_8 -环烷基羰基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_3-C_8 -环烷氧基、 C_3-C_8 -卤代环烷氧基、 C_1-C_6 -烷基羰基氧基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_1-C_6 -卤代烷硫基、 C_3-C_6 -环烷硫基、 C_1-C_6 -烷基磺酰基、 C_1-C_6 -卤代烷基磺酰基或 C_3-C_8 -环烷基磺酰基,

[0140] Z^{1-6} 相同或不同, 且各自独立地是氢、氰基、卤素、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -卤代烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_2-C_6 -卤代炔基、 C_1-C_6 -烷氧基、 C_1-C_6 -卤代烷氧基、 C_1-C_6 -烷硫基、 C_1-C_6 -烷基羰基、 C_1-C_6 -烷氧基羰基、 C_1-C_6 -烷基羰基氧基、 C_1-C_6 -卤代烷硫基或苯基,

[0141] Z^2 相同或不同, 且独立地是氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_2-C_6 -烯基、 C_2-C_6 -炔基、 C_1-C_6 -卤代烷

基、C₂-C₆-卤代烯基、C₂-C₆-卤代炔基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、苯基、苄基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、C₁-C₆-烷氧基羰基、C₁-C₆-卤代烷氧基羰基、苯基磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、-C(=O)H、C₁-C₃-卤代烷基羰基或C₁-C₃-烷基羰基，

[0142] L³ 优选是直连键、-CH₂-、硫、氧或-(S=O)₂，且更优选是直连键，

[0143] L⁴ 优选是-C(=O)O-、-C(=O)NH-、-OC(=O)-、-NHC(=O)-或-OCH₂C≡C-，且更优选是-OCH₂C≡C-或-C(=O)O-，

[0144] Z³ 优选是苯基、萘基、或5元或6元杂芳基，其可含有最多两个取代基，其中取代基各自独立地选自以下基团：

[0145] 卤素、氰基、硝基、羟基、氨基、-SH、C₁-C₄-烷基、C₂-C₄-烯基、C₂-C₄-炔基、C₁-C₄-卤代烷基、C₂-C₄-卤代烯基、C₂-C₄-卤代炔基、C₂-C₄-烷氧基烷基、C₁-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-卤代烷基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-卤代烷氧基、C₂-C₆-烯基氧基、C₂-C₆-炔基氧基、C₁-C₄-烷硫基、C₁-C₄-卤代烷硫基、C₁-C₄-烷基磺酰基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基或C₁-C₄-烷基氨基、二(C₁-C₄-烷基)氨基，

[0146] 氮上的取代基：氢、C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₁-C₆-卤代烷基、C₂-C₆-卤代烯基、C₂-C₆-卤代炔基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、苯基、苄基、C₁-C₄-卤代烷基磺酰基、C₁-C₆-烷氧基羰基、C₁-C₆-卤代烷氧基羰基、苯基磺酰基、C₁-C₄-烷基磺酰基、-C(=O)H或C₁-C₃-烷基羰基，以及

[0147] Z³ 更优选是可含有最多两个取代基的苯基，其中取代基各自独立地选自以下基团：

[0148] 氯、溴、碘、氟、氰基、硝基、羟基、氨基、-SH、甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基、1,1-二甲基乙基、乙烯基、丙烯-2-基、乙炔基、丙炔-2-基、三氟甲基、二氟甲基、甲氧基甲基、甲基羰基、乙基羰基、三氟甲基羰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、正丙氧基羰基、1-甲基乙氧基羰基、1,1-二甲基乙氧基羰基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、1-甲基乙氧基、1,1-二甲基乙氧基、三氟甲氧基、乙烯基氧基、2-丙烯基氧基、乙炔基氧基、2-丙炔基氧基、甲硫基、乙硫基、三氟甲硫基、甲基磺酰基、乙基磺酰基、丙基亚磺酰基(propylthionyl)、1-甲基乙硫基、三氟甲基磺酰基、甲基氨基、乙基氨基、正丙基氨基、1-甲基乙基氨基、1,1-二甲基乙基氨基或二甲基氨基，或者

[0149] Z³ 更优选是萘基，

[0150] Z⁴ 优选是-SH、-C(=O)H、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷硫基烷基、C₁-C₆-烷基亚磺酰基-C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷基磺酰基-C₁-C₆-烷基、C₄-C₆-烷基羰基、C₁-C₆-卤代烷基羰基、C₃-C₆-环烷氧基羰基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₆-烷氧基羰基、C₃-C₆-环烷基氨基羰基、C₁-C₆-卤代烷氧基-C₁-C₆-烷基、C₅-C₆-烷氧基、C₅-C₆-卤代烷氧基、C₂-C₆-烯基氧基、C₂-C₆-卤代烯基氧基、C₂-C₆-炔基氧基、C₂-C₆-卤代炔基氧基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₆-烷氧基、C₁-C₆-卤代烷基羰基氧基、C₃-C₆-环烷基羰基氧基、C₁-C₆-烷基羰基-C₁-C₆-烷氧基、C₅-C₆-烷硫基、C₅-C₆-卤代烷硫基、C₅-C₆-卤代烷基亚磺酰基、C₅-C₆-卤代烷基磺酰基、C₁-C₆-烷基磺酰基氨基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基氨基、氰基-C₁-C₆-烷基、C₂-C₆-烯基羰基氧基、C₂-C₆-炔基磺基、C₃-C₈-卤代环烷基羰基氧基、C₂-C₆-烯基氨基、C₂-C₆-炔基氨基、C₁-C₆-卤代烷基氨基、C₃-C₈-环烷基-C₁-C₆-烷基氨基、C₁-C₆-烷氧基氨基、C₁-C₆-卤代烷氧基氨基、C₁-C₆-烷基羰基氨基、C₁-C₆-卤代烷基羰基氨基、C₁-C₆-烷氧基羰基氨基、C₁-C₆-烷基羰基(C₁-C₆-烷基)氨基、

C₁-C₆-卤代烷基羰基 (C₁-C₆-烷基) 氨基、C₁-C₆-烷氧基羰基 (C₁-C₆-烷基) 氨基、C₂-C₆-烯基硫基、C₁-C₆-卤代烷氧基羰基、C₁-C₆-烷氧基-C₁-C₄-烷基羰基、-SF₅、C₁-C₆-卤代烷氧基羰基氨基、-NHC(=O)H、C₁-C₆-烷氧基 (C₁-C₄-烷基) 氨基羰基、C₁-C₆-烷氧基羰基-C₁-C₆-烷氧基、二 (C₁-C₆-烷基) 氨基羰基氨基、二 (C₁-C₆-烷基) 氨基磺酰基、二 (C₁-C₆-卤代烷基) 氨基、C₁-C₆-烷基氨基磺酰基、C₁-C₆-烷基氨基羰基氨基、三 (C₁-C₄-烷基) 甲硅烷基氧基、C₁-C₆-卤代烷基磺酰基氧基、C₁-C₆-烷基磺酰基氧基、三 (C₁-C₄-烷基) 甲硅烷基-C₂-C₄-炔基氧基、三 (C₁-C₄-烷基) 甲硅烷基-C₂-C₄-炔基、C₂-C₄-炔基羰基氧基、氰基-C₁-C₃-烷基羰基氧基、C₃-C₈-环烷基磺酰基氧基、C₃-C₈-卤代环烷基磺酰基氧基、C₂-C₄-烯基磺酰基氧基、C₁-C₃-烷基氨基羰基氧基、C₂-C₄-炔基-C₃-C₈-环烷基氧基、氰基羰基氧基、氰基-C₂-C₄-烯基氧基、-C(=NOR⁹)R¹³、-C(=O)OH、-C(=O)NH₂、-C(=S)NR¹¹R¹²、-NR¹¹R¹²、-C(=O)NR¹¹R¹²、-SO₂NR¹¹R¹²、-NR¹²SO₂Z³、-O(C=O)H、-SCN、C₁-C₃-烷氧基磺酰基、C₃-C₈-环烷基亚磺酰基、氰基 (C₁-C₃-烷氧基)-C₁-C₃-烷基或-L⁴Z³, 或者

[0151] Z⁴ 优选是含有1或2个取代基的C₁-C₃-烷基, 其中取代基各自独立地选自以下基团:

[0152] 氰基、-C(=O)H、C₂-C₄-烯基氧基、C₂-C₄-炔基氧基、C₂-C₄-烯基硫基、C₂-C₄-炔基硫基、C₁-C₃-卤代烷硫基、C₂-C₄-烯基亚磺酰基、C₂-C₄-炔基亚磺酰基、C₁-C₃-卤代烷基亚磺酰基、C₂-C₄-烯基磺酰基、C₂-C₄-炔基磺酰基、C₁-C₃-卤代烷基磺酰基、C₁-C₃-烷基羰基氧基、C₁-C₃-卤代烷基羰基氧基、C₁-C₃-烷基氨基羰基氧基、C₁-C₃-烷基羰基氨基、C₁-C₃-烷基氨基羰基氨基、C₁-C₃-卤代烷基羰基氨基、C₁-C₃-烷基磺酰基氨基、C₁-C₃-卤代烷基磺酰基氨基、C₁-C₃-烷硫基羰基氧基、氰基-C₁-C₃-烷氧基、C₃-C₈-环烷基-C₁-C₃-烷氧基、C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷硫基、C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基亚磺酰基、C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基磺酰基、C₁-C₃-卤代烷氧基-C₁-C₃-烷氧基、C₁-C₃-烷基羰基-C₁-C₃-烷氧基、C₂-C₄-烷硫基-C₁-C₃-烷氧基、二 (C₁-C₃-烷基) 氨基羰基氨基、三 (C₁-C₄-烷基) 甲硅烷基氧基,

[0153] 或者

[0154] Z⁴ 优选是含有1或2个取代基的C₁-C₃-烷氧基, 其中取代基各自独立地选自以下基团:

[0155] 氰基、C₁-C₃-烷基羰基氧基、C₁-C₃-烷氧基羰基、C₃-C₈-环烷基氧基、C₁-C₃-烷基羰基氧基、-O(C=O)H、C₁-C₃-烷硫基、羟基-C₁-C₃-烷基、C₃-C₈-环烷基磺酰基、C₁-C₃-卤代烷基磺酰基、C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷氧基、C₁-C₃-烷基磺酰基, 或者

[0156] Z⁴ 优选是含有1或2个取代基的C₂-C₄-烯基氧基, 其中取代基各自独立地选自以下基团:

[0157] C₃-C₈-环烷基、羟基、C₁-C₃-烷氧基、C₁-C₃-烷氧基羰基、C₁-C₃-烷基羰基, 或者

[0158] Z⁴ 优选是含有1或2个取代基的C₂-C₄-炔基氧基, 其中取代基各自独立地选自以下基团:

[0159] C₃-C₈-环烷基、-Z³,

[0160] Z⁴ 更优选是甲酰基、甲氧基甲氧基、2-甲氧基乙氧基、烯丙氧基、2-氟丙-2-烯-1-基氧基、2-氯丙-2-烯-1-基氧基、3-氯丙-2-烯-1-基氧基、2-溴丙-2-烯-1-基氧基、2-甲基丙-2-烯-1-基氧基、3,3-二氯丙-2-烯-1-基氧基、3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基氧基、丁-2-烯-1-基氧基、丁-3-烯-2-基氧基、丁-3-烯-1-基氧基、3-氯丁-2-烯-1-基氧基、3-甲基丁-

2-烯-1-基氧基、4,4,4-三氟丁-2-烯-1-基氧基、丙-2-炔-1-基氧基、3-氯丙-2-炔-1-基氧基、3-溴丙-2-炔-1-基氧基、丁-2-炔-1-基氧基、戊-2-炔-1-基氧基、2-氟-2-甲基丙酰基氧基、3,3,3-三氟丙酰基氧基、环丙基羰基氧基、环己基羰基氧基、(1-氯环丙基)羰基氧基、丁-2-烯酰氧基、丙烯酰氧基、氰基甲氧基、甲基磺酰基氧基、乙基磺酰基氧基、三氟甲基磺酰基氧基、环丙基磺酰基氧基、2-甲氧基乙氧基甲基、烯丙氧基甲基、丙-2-炔-1-基氧基甲基、甲基磺酰基甲基、甲基羰基氨基甲基、甲基磺酰基氨基甲基、 $-C(=NOR^9)R^{13}$ 、二甲基氨基磺酰基、乙基氨基磺酰基、三甲基甲硅烷基乙炔基、二乙基氨基磺酰基、甲基氨基磺酰基、三甲基甲硅烷基氧基、三甲基甲硅烷基丙-2-炔-1-基氧基、三氟甲基氨基、二甲基氨基羰基氨基、 $-C(=O)OH$ 、 $-NHC(=O)H$ 、 $-C(=O)NH_2$ 、 $-C(=S)NR^{11}R^{12}$ 、1,1-二甲基乙基羰基氨基、氯甲基羰基氨基、三氟甲基羰基氨基、1,1-二甲基乙氧基羰基氨基、乙基羰基氨基、1-甲基乙氧基羰基氨基、三氟甲基羰基氨基、甲基羰基氨基、甲氧基羰基氨基、乙氧基羰基氨基、异丙氧基羰基氨基、1-甲基乙基羰基氨基、甲基磺酰基氨基或苯基磺酰基氨基、3-溴丙-2-烯-1-基氧基或 $-L^4Z^3$ ，

[0161] R^9 优选是氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、苄基或 Z^3 ，

[0162] R^{13} 优选是氢、 C_1-C_6 -烷基、 C_1-C_6 -卤代烷基、 C_3-C_8 -环烷基- C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_8 -环烷基、 C_1-C_4 -烷基- C_3-C_8 -环烷基、 C_1-C_4 -卤代烷基- C_3-C_8 -环烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -卤代烷氧基- C_1-C_4 -烷基、苄基或苯基，更优选是氢、甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基、正丁基、1,1-二甲基乙基或2-甲基丙基，

[0163] R^{11} 和 R^{12} 相同或不同，且优选是氢、 C_3-C_4 -烯基、 C_3-C_4 -炔基、氰基- C_1-C_3 -烷基、甲酰基、 C_1-C_3 -卤代烷基、苯基、 C_1-C_3 -烷基羰基、 C_3-C_8 -环烷氧基羰基、 C_1-C_3 -烷氧基羰基、 C_3-C_4 -烯基氧基羰基、 C_3-C_4 -炔基氧基羰基、 C_1-C_3 -卤代烷基羰基、 C_3-C_8 -卤代环烷基羰基、 C_3-C_8 -环烷氧基羰基、 C_3-C_8 -环烷基羰基、二(C_1-C_3 -烷基)氨基羰基。

[0164] 本发明可用的杂芳基哌啶和杂芳基哌嗪的丙二酸酯衍生物通过式(I)概括地定义。式(I)的以上基团定义以及在后详细说明的基团定义适用于式(I)的最终产物，也同样适用于所有中间体(还可参见下文“对方法和中间体的说明”)。

[0165] 上下文概括列出或以优选范围列出的基团的定义和说明可以根据需要彼此结合，即包括具体范围和优选范围的组合。这些基团的定义和说明均适用于最终产物和相应的前体和中间体。而且，个别定义可能不适用。

[0166] 以上具体说明的基团定义可以按需要彼此组合。而且，个别定义可能不适用。

[0167] 根据上述定义的取代基的种类，式(I)化合物具有酸性或碱性且可以与无机酸或有机酸或碱或金属离子形成盐，还可能形成内盐或加成物。如果式(I)化合物带有氨基、烷基氨基或其他诱发碱性的基团，则这些化合物可以与酸反应生成盐，或通过合成直接作为盐获得。如果式(I)化合物带有羟基、羧基或其他诱发酸性的基团，则这些化合物可与碱反应生成盐。适宜的碱例如碱金属和碱土金属的氢氧化物、碳酸盐、碳酸氢盐，特别是钠、钾、镁和钙的氢氧化物、碳酸盐、碳酸氢盐，以及氨、具有 C_1-C_4 -烷基基团的伯胺、仲胺和叔胺， C_1-C_4 -烷醇的单烷醇胺、二烷醇胺和三烷醇胺，胆碱以及氯胆碱。

[0168] 以此方法得到的盐同样具有杀真菌特性。

[0169] 无机酸的实例为氢卤酸，例如氟化氢、氯化氢、溴化氢和碘化氢、硫酸、磷酸和硝酸，及酸式盐，例如 $NaHSO_4$ 和 $KHSO_4$ 。有用的有机酸包括例如甲酸、碳酸，和烷酸如乙酸、三氟

乙酸、三氯乙酸和丙酸,以及乙醇酸、硫氰酸、乳酸、丁二酸、柠檬酸、苯甲酸、肉桂酸、草酸、饱和或单不饱和或二不饱和的C₆-C₂₀脂肪酸、烷基硫酸单酯、烷基磺酸(具有1-20个碳原子的直链或支链烷基的磺酸)、芳基磺酸或芳基二磺酸(带有一个或两个磺酸基团的芳族基团,例如苯基和萘基)、烷基膦酸(具有1-20个碳原子的直链或支链烷基的膦酸)、芳基膦酸或芳基二膦酸(带有一个或两个膦酸基团的芳族基团,例如苯基和萘基),其中所述烷基和芳基基团可带有其他取代基,例如对甲苯磺酸、水杨酸、对氨基水杨酸、2-苯氧基苯甲酸、2-乙酰氧基苯甲酸等。

[0170] 有用的金属离子尤其为第二主族元素(尤其是钙和镁)、第三和第四主族元素(尤其是铝、锡和铅)以及第一至第八过渡族元素(尤其是铬、锰、铁、钴、镍、铜、锌及其他)的离子。特别优选第四周期元素的金属离子。此处,所述金属可以以其可能具有的多种价态存在。

[0171] 任选地取代的基团可以是单取代的或多取代的,其中在多取代的情况下,取代基可以相同或不同。

[0172] 在上式中给出的符号的定义中,使用通常代表以下取代基的统称:

[0173] 卤素:氟、氯、溴和碘且优选氟、氯、溴且更优选氟、氯。

[0174] 烷基:具有1-8个、优选1-6个且更优选1-3个碳原子的饱和的直链或支链烃基,例如(但不限于)C₁-C₆-烷基,如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基和1-乙基-2-甲基丙基。该定义同样适用于作为复合取代基的一部分的烷基,所述复合取代基例如环烷基烷基、羟烷基等,除非另有说明,例如烷基磺基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷基或卤代烷基磺基。如果所述烷基在复合取代基的末端,例如,在烷基环烷基中,在复合取代基的起始端部分(例如环烷基)可以被烷基相同或不同地且独立地单取代或多取代。这同样适用于其他基团(例如烯基、炔基、羟基、卤素、甲酰基等)在末端的复合取代基。

[0175] 烯基:具有2-8个、优选2-6个碳原子和一个在任何位置的双键的不饱和的直链或支链烃基,例如(但不限于)C₂-C₆烯基,如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,

3-二甲基-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、3,3-二甲基-2-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基和1-乙基-2-甲基-2-丙烯基。该定义同样适用于作为复合取代基——例如卤代烯基等——的一部分的烯基,除非另有说明。

[0176] 炔基:具有2-8个、优选2-6个碳原子和一个在任何位置的三键的直链或支链炔基,例如(但不限于) C_2-C_6 炔基,如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、3-甲基-1-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、1-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-1-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、4-甲基-1-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基和1-乙基-1-甲基-2-丙炔基。该定义同样适用于作为复合取代基——例如卤代炔基等——的一部分的炔基,除非另有说明。

[0177] 烷氧基:具有1-8个、优选1-6个且更优选1-3个碳原子的饱和的直链或支链烷氧基,例如(但不限于) C_1-C_6 -烷氧基,如甲氧基、乙氧基、丙氧基、1-甲基乙氧基、丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基、1,1-二甲基乙氧基、戊氧基、1-甲基丁氧基、2-甲基丁氧基、3-甲基丁氧基、2,2-二甲基丙氧基、1-乙基丙氧基、己氧基、1,1-二甲基丙氧基、1,2-二甲基丙氧基、1-甲基戊氧基、2-甲基戊氧基、3-甲基戊氧基、4-甲基戊氧基、1,1-二甲基丁氧基、1,2-二甲基丁氧基、1,3-二甲基丁氧基、2,2-二甲基丁氧基、2,3-二甲基丁氧基、3,3-二甲基丁氧基、1-乙基丁氧基、2-乙基丁氧基、1,1,2-三甲基丙氧基、1,2,2-三甲基丙氧基、1-乙基-1-甲基丙氧基和1-乙基-2-甲基丙氧基。该定义同样适用于作为复合取代基的一部分的烷氧基,所述复合取代基例如卤代烷氧基、炔基烷氧基等,除非另有说明。

[0178] 烷硫基:具有1-8个、优选1-6个且更优选1-3个碳原子的饱和的直链或支链烷硫基,例如(但不限于) C_1-C_6 -烷硫基,如甲硫基、乙硫基、丙硫基、1-甲基乙硫基、丁硫基、1-甲基丙硫基、2-甲基丙硫基、1,1-二甲基乙硫基、戊硫基、1-甲基丁硫基、2-甲基丁硫基、3-甲基丁硫基、2,2-二甲基丙硫基、1-乙基丙硫基、己硫基、1,1-二甲基丙硫基、1,2-二甲基丙硫基、1-甲基戊硫基、2-甲基戊硫基、3-甲基戊硫基、4-甲基戊硫基、1,1-二甲基丁硫基、1,2-二甲基丁硫基、1,3-二甲基丁硫基、2,2-二甲基丁硫基、2,3-二甲基丁硫基、3,3-二甲基丁硫基、1-乙基丁硫基、2-乙基丁硫基、1,1,2-三甲基丙硫基、1,2,2-三甲基丙硫基、1-乙基-1-甲基丙硫基和1-乙基-2-甲基丙硫基。该定义同样适用于作为复合取代基——例如卤代烷硫基等——的一部分的烷硫基,除非另有说明。

[0179] 烷氧基羰基:具有1-6个、优选1-3个碳原子并通过羰基($-CO-$)键接在骨架上的烷氧基(如上所述)。该定义同样适用于作为复合取代基——例如环烷基烷氧基羰基等——的一部分的烷氧基羰基,除非另有说明。

[0180] 烷基亚磺酰基:具有1-8个、优选1-6个且更优选1-3个碳原子的饱和的直链或支链烷基亚磺酰基,例如(但不限于) C_1-C_6 -烷基亚磺酰基,如甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、丙基

亚磺酰基、1-甲基乙基亚磺酰基、丁基亚磺酰基、1-甲基丙基亚磺酰基、2-甲基丙基亚磺酰基、1,1-二甲基乙基亚磺酰基、戊基亚磺酰基、1-甲基丁基亚磺酰基、2-甲基丁基亚磺酰基、3-甲基丁基亚磺酰基、2,2-二甲基丙基亚磺酰基、1-乙基丙基亚磺酰基、己基亚磺酰基、1,1-二甲基丙基亚磺酰基、1,2-二甲基丙基亚磺酰基、1-甲基戊基亚磺酰基、2-甲基戊基亚磺酰基、3-甲基戊基亚磺酰基、4-甲基戊基亚磺酰基、1,1-二甲基丁基亚磺酰基、1,2-二甲基丁基亚磺酰基、1,3-二甲基丁基亚磺酰基、2,2-二甲基丁基亚磺酰基、2,3-二甲基丁基亚磺酰基、3,3-二甲基丁基亚磺酰基、1-乙基丁基亚磺酰基、2-乙基丁基亚磺酰基、1,1,2-三甲基丙基亚磺酰基、1,2,2-三甲基丙基亚磺酰基、1-乙基-1-甲基丙基亚磺酰基和1-乙基-2-甲基丙基亚磺酰基。该定义同样适用于作为复合取代基——例如卤代烷基亚磺酰基等——的一部分的烷基亚磺酰基,除非另有说明。

[0181] 烷基磺酰基:具有1-8个、优选1-6个且更优选1-3个碳原子的饱和的直链或支链烷基磺酰基,例如(但不限于) C_1 - C_6 -烷基磺酰基,如甲基磺酰基、乙基磺酰基、丙基磺酰基、1-甲基乙基磺酰基、丁基磺酰基、1-甲基丙基磺酰基、2-甲基丙基磺酰基、1,1-二甲基乙基磺酰基、戊基磺酰基、1-甲基丁基磺酰基、2-甲基丁基磺酰基、3-甲基丁基磺酰基、2,2-二甲基丙基磺酰基、1-乙基丙基磺酰基、己基磺酰基、1,1-二甲基丙基磺酰基、1,2-二甲基丙基磺酰基、1-甲基戊基磺酰基、2-甲基戊基磺酰基、3-甲基戊基磺酰基、4-甲基戊基磺酰基、1,1-二甲基丁基磺酰基、1,2-二甲基丁基磺酰基、1,3-二甲基丁基磺酰基、2,2-二甲基丁基磺酰基、2,3-二甲基丁基磺酰基、3,3-二甲基丁基磺酰基、1-乙基丁基磺酰基、2-乙基丁基磺酰基、1,1,2-三甲基丙基磺酰基、1,2,2-三甲基丙基磺酰基、1-乙基-1-甲基丙基磺酰基和1-乙基-2-甲基丙基磺酰基。该定义同样适用于作为复合取代基——例如烷基磺酰基烷基等——的一部分的烷基磺酰基,除非另有说明。

[0182] 环烷基:具有3-10个、优选3-8个且更优选3-6个碳环成员的单环饱和烃基,例如(但不限于)环丙基、环戊基和环己基。该定义同样适用于作为复合取代基——例如环烷基烷基等——的一部分的环烷基,除非另有说明。

[0183] 环烯基:具有3-10个、优选3-8个且更优选3-6个碳环成员的单环部分不饱和烃基,例如(但不限于)环丙烯基、环戊烯基和环己烯基。该定义同样适用于作为复合取代基——例如环烯基烷基等——的一部分的环烯基,除非另有说明。

[0184] 环烷氧基:具有3-10个、优选3-8个且更优选3-6个碳环成员的单环饱和环烷氧基,例如(但不限于)环丙氧基、环戊氧基和环己氧基。该定义同样适用于作为复合取代基——例如环烷氧基烷基等——的一部分的环烷氧基,除非另有说明。

[0185] 卤代烷基:具有1-8个、优选1-6个且更优选1-3个碳原子的直链或支链烷基(如上所述),其中这些基团中的一些或全部氢原子可被上述卤原子替代,例如(但不限于) C_1 - C_3 -卤代烷基,如氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基和1,1,1-三氟丙-2-基。该定义同样适用于作为复合取代基——例如卤代烷基氨基烷基等——的一部分的卤代烷基,除非另有说明。

[0186] 卤代烯基和卤代炔基的定义类似于卤代烷基,不同之处在于烯基和炔基代替烷基作为取代基的一部分存在。

[0187] 卤代烷氧基:具有1-8个、优选1-6个且更优选1-3个碳原子的直链或支链烷氧基(如上所述),其中这些基团中的一些或全部氢原子可被上述卤原子替代,例如(但不限于)C₁-C₃-卤代烷氧基,如氯甲氧基、溴甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、1-氯乙氧基、1-溴乙氧基、1-氟乙氧基、2-氟乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基和1,1,1-三氟丙-2-氧基。该定义同样适用于作为复合取代基——例如卤代烷氧基烷基等——的一部分的卤代烷氧基,除非另有说明。

[0188] 卤代烷硫基:具有1-8个、优选1-6个且更优选1-3个碳原子的直链或支链烷硫基(如上所述),其中这些基团中的一些或全部氢原子可被上述卤原子替代,例如(但不限于)C₁-C₃-卤代烷硫基,如氯甲硫基、溴甲硫基、二氯甲硫基、三氯甲硫基、氟甲硫基、二氟甲硫基、三氟甲硫基、氯氟甲硫基、二氯氟甲硫基、氯二氟甲硫基、1-氯乙硫基、1-溴乙硫基、1-氟乙硫基、2-氟乙硫基、2,2-二氟乙硫基、2,2,2-三氟乙硫基、2-氯-2-氟乙硫基、2-氯-2,2-二氟乙硫基、2,2-二氯-2-氟乙硫基、2,2,2-三氯乙硫基、五氟乙硫基和1,1,1-三氟丙-2-硫基。该定义同样适用于作为复合取代基——例如卤代烷硫基烷基等——的一部分的卤代烷硫基,除非另有说明。

[0189] 杂芳基:含有1至4个选自氧、氮和硫的杂原子的5元或6元完全不饱和单环体系;如果所述环含有多于1个氧原子,则这些氧原子不直接相邻;

[0190] 含1至4个氮原子或1至3个氮原子和1个硫或氧原子的5元杂芳基:除碳原子外还可含有1至4个氮原子或1至3个氮原子和1个硫或氧原子作为环成员的5元杂芳基,例如(但不限于)2-呋喃基、3-呋喃基、2-噁吩基、3-噁吩基、2-吡咯基、3-吡咯基、3-异噁唑基、4-异噁唑基、5-异噁唑基、3-异噻唑基、4-异噻唑基、5-异噻唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、2-咪唑基、4-咪唑基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,2,4-三唑-3-基、1,3,4-噁二唑-2-基、1,3,4-噻二唑-2-基和1,3,4-三唑-2-基;

[0191] 通过氮连接并含有1至4个氮原子的5元杂芳基,或通过氮连接并含有1至3个氮原子的苯并稠合的5元杂芳基:除碳原子外还可含有1至4个氮原子或1至3个氮原子作为环成员并且其中两个相邻的碳环成员或一个氮和一个相邻的碳环成员可通过一个丁-1,3-二烯-1,4-二基基团——其中一个或两个碳原子可被氮原子替代——桥连的5元杂芳基,其中这些环通过一个氮环成员连至骨架上,例如(但不限于)1-吡咯基、1-吡唑基、1,2,4-三唑-1-基、1-咪唑基、1,2,3-三唑-1-基和1,3,4-三唑-1-基;

[0192] 含有1至4个氮原子的6元杂芳基:除碳原子外还可含有1至3个和1至4个氮原子作为环成员的6元杂芳基,例如(但不限于)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-基和1,2,4-三嗪-3-基和1,2,4,5-四嗪-3-基;

[0193] 含有1至3个氮原子或一个氮原子和一个氧或硫原子的苯并稠合的5元杂芳基:例如(但不限于)吲哚-1-基、吲哚-2-基、吲哚-3-基、吲哚-4-基、吲哚-5-基、吲哚-6-基、吲哚-7-基、苯并咪唑-1-基、苯并咪唑-2-基、苯并咪唑-4-基、苯并咪唑-5-基、吲唑-1-基、吲唑-3-基、吲唑-4-基、吲唑-5-基、吲唑-6-基、吲唑-7-基、吲唑-2-基、1-苯并呋喃-2-基、1-苯并

呋喃-3-基、1-苯并呋喃-4-基、1-苯并呋喃-5-基、1-苯并呋喃-6-基、1-苯并呋喃-7-基、1-苯并噁吩-2-基、1-苯并噁吩-3-基、1-苯并噁吩-4-基、1-苯并噁吩-5-基、1-苯并噁吩-6-基、1-苯并噁吩-7-基、1,3-苯并噁唑-2-基、1,3-苯并噁唑-4-基、1,3-苯并噁唑-5-基、1,3-苯并噁唑-6-基、1,3-苯并噁唑-7-基、1,3-苯并噁唑-2-基、1,3-苯并噁唑-4-基、1,3-苯并噁唑-5-基、1,3-苯并噁唑-6-基和1,3-苯并噁唑-7-基；

[0194] 含1至3个氮原子的苯并稠合的6元杂芳基：例如(但不限于)喹啉-2-基、喹啉-3-基、喹啉-4-基、喹啉-5-基、喹啉-6-基、喹啉-7-基、喹啉-8-基、异喹啉-1-基、异喹啉-3-基、异喹啉-4-基、异喹啉-5-基、异喹啉-6-基、异喹啉-7-基和异喹啉-8-基。

[0195] 该定义也适用于作为复合取代基——例如杂芳基烷基等——的一部分的杂芳基，除非另有说明。

[0196] 杂环基：含有1至4个选自氧、氮和硫的杂原子的3元至15元、优选3元至9元饱和或部分不饱和杂环；除碳环成员外还含有1至3个氮原子和/或一个氧或硫原子或一个或两个氧和/或硫原子的单环、双环或三环杂环；如果所述环含有多于1个氧原子，则这些氧原子不直接相邻；例如(但不限于)环氧乙基、氮丙啶基、2-四氢呋喃基、3-四氢呋喃基、2-四氢噁吩基、3-四氢噁吩基、2-吡咯烷基、3-吡咯烷基、3-异噁唑烷基、4-异噁唑烷基、5-异噁唑烷基、3-异噁唑烷基、4-异噁唑烷基、5-异噁唑烷基、3-吡唑烷基、4-吡唑烷基、5-吡唑烷基、2-噁唑烷基、4-噁唑烷基、5-噁唑烷基、2-咪唑烷基、4-咪唑烷基、1,2,4-噁二唑烷-3-基、1,2,4-噁二唑烷-5-基、1,2,4-噁二唑烷-3-基、1,2,4-噁二唑烷-5-基、1,2,4-三唑烷-3-基、1,3,4-噁二唑烷-2-基、1,3,4-噁二唑烷-2-基、1,3,4-三唑烷-2-基、2,3-二氢呋喃-2-基、2,3-二氢呋喃-3-基、2,4-二氢呋喃-2-基、2,4-二氢呋喃-3-基、2,3-二氢噁吩-2-基、2,3-二氢噁吩-3-基、2,4-二氢噁吩-2-基、2,4-二氢噁吩-3-基、2-吡咯啉-2-基、2-吡咯啉-3-基、3-吡咯啉-2-基、3-吡咯啉-3-基、2-异噁唑啉-3-基、3-异噁唑啉-3-基、4-异噁唑啉-3-基、2-异噁唑啉-4-基、3-异噁唑啉-4-基、4-异噁唑啉-4-基、2-异噁唑啉-5-基、3-异噁唑啉-5-基、4-异噁唑啉-5-基、2-异噁唑啉-3-基、3-异噁唑啉-3-基、4-异噁唑啉-3-基、2-异噁唑啉-4-基、3-异噁唑啉-4-基、4-异噁唑啉-4-基、2-异噁唑啉-5-基、3-异噁唑啉-5-基、4-异噁唑啉-5-基、2,3-二氢吡唑-1-基、2,3-二氢吡唑-2-基、2,3-二氢吡唑-3-基、2,3-二氢吡唑-4-基、2,3-二氢吡唑-5-基、3,4-二氢吡唑-1-基、3,4-二氢吡唑-3-基、3,4-二氢吡唑-4-基、3,4-二氢吡唑-5-基、4,5-二氢吡唑-1-基、4,5-二氢吡唑-3-基、4,5-二氢吡唑-4-基、4,5-二氢吡唑-5-基、2,3-二氢噁唑-2-基、2,3-二氢噁唑-3-基、2,3-二氢噁唑-4-基、2,3-二氢噁唑-5-基、3,4-二氢噁唑-2-基、3,4-二氢噁唑-3-基、3,4-二氢噁唑-4-基、3,4-二氢噁唑-5-基、3,4-二氢噁唑-2-基、3,4-二氢噁唑-3-基、3,4-二氢噁唑-4-基、2-哌啶基、3-哌啶基、4-哌啶基、1,3-二噁烷-5-基、2-四氢吡喃基、4-四氢吡喃基、2-四氢噁吩基、3-六氢哒嗪基、4-六氢哒嗪基、2-六氢嘧啶基、4-六氢嘧啶基、5-六氢嘧啶基、2-哌嗪基、1,3,5-六氢三嗪-2-基和1,2,4-六氢三嗪-3-基。该定义也适用于作为复合取代基——例如杂环基烷基等——的一部分的杂环基，除非另有说明。

[0197] 离去基团： S_N1 或 S_N2 离去基团，例如氯、溴、碘、烷基磺酸酯基(-OSO₂-烷基，例如-OSO₂CH₃、-OSO₂CF₃)或芳基磺酸酯基(-OSO₂-芳基，例如-OSO₂Ph、-OSO₂PhMe)。

[0198] 不包括违背自然规律且因此本领域技术人员根据其专业知识而排除的那些组合。例如，排除具有三个以上的相邻氧原子的环结构。

[0199] 对制备方法和中间体的说明

[0200] 可以使用不同的方法制备式 (I) 的哌啶羧酸衍生物。首先,以下示意性地给出了可能的方法。除非另有说明,所述基团各自定义如上。

[0201] 本发明用于制备式 (I) 化合物的方法任选地使用一种或多种反应助剂进行。

[0202] 如需要,有用的反应助剂为无机或有机碱或酸的受体。这些优选包括碱金属或碱土金属的乙酸盐、酰胺、碳酸盐、碳酸氢盐、氢化物、氢氧化物或醇盐,例如乙酸钠、乙酸钾或乙酸钙,氨基锂、氨基钠、氨基钾或氨基钙,碳酸钠、碳酸钾或碳酸钙,碳酸氢钠、碳酸氢钾或碳酸氢钙,氢化锂、氢化钠、氢化钾或氢化钙,氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾或氢氧化钙,甲醇钠、乙醇钠、正丙醇钠或异丙醇钠,正丁醇钠、异丁醇钠、仲丁醇钠或叔丁醇钠,或甲醇钾、乙醇钾、正丙醇钾或异丙醇钾、正丁醇钾、异丁醇钾、仲丁醇钾或叔丁醇钾;以及碱性有机氮化合物,例如三甲胺、三乙胺、三丙胺、三丁胺、乙基二异丙胺、N,N-二甲基环己基胺、二环己基胺、乙基二环己基胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苄基胺、吡啶、2-甲基吡啶、3-甲基吡啶、4-甲基吡啶、2,4-二甲基吡啶、2,6-二甲基吡啶、3,4-二甲基吡啶和3,5-二甲基吡啶、5-乙基-2-甲基吡啶、4-二甲氨基吡啶、N-甲基哌啶、1,4-二氮杂双环[2.2.2]辛烷(DABCO)、1,5-二氮杂双环[4.3.0]壬-5-烯(DBN)或1,8-二氮杂双环[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU)。

[0203] 如需要,有用的反应助剂为无机酸或有机酸。这些优选包括无机酸,如氟化氢、氯化氢、溴化氢和碘化氢、硫酸、磷酸和硝酸;及酸式盐,例如NaHSO₄和KHSO₄;或有机酸例如甲酸、碳酸,和烷酸,如乙酸、三氟乙酸、三氯乙酸和丙酸以及乙醇酸、硫氰酸、乳酸、丁二酸、柠檬酸、苯甲酸、肉桂酸、草酸、饱和或单不饱和或二不饱和C₆-C₂₀脂肪酸、烷基硫酸单酯、烷基磺酸(具有1-20个碳原子的直链或支链烷基的磺酸)、芳基磺酸或芳基二磺酸(带有一个或两个磺酸基团的芳族基团,例如苯基和萘基)、烷基膦酸(具有1-20个碳原子的直链或支链烷基的膦酸)、芳基膦酸或芳基二膦酸(带有一个或两个膦酸基团的芳族基团,例如苯基和萘基),其中所述烷基和芳基基团可带有其他取代基,例如对甲苯磺酸、水杨酸、对氨基水杨酸、2-苯氧基苯甲酸、2-乙酰氧基苯甲酸等。

[0204] 本发明的方法任选地使用一种或多种稀释剂进行。有用的稀释剂是几乎所有的惰性有机溶剂。所述有机溶剂优选包括脂肪族和芳香族的任选被卤代的烃,例如戊烷、己烷、庚烷、环己烷、甲基环己烷、石油醚、汽油(benzine)、粗汽油(ligroin)、苯、甲苯、二甲苯、二氯甲烷、氯化乙烯、三氯甲烷、四氯化碳、氯苯和邻二氯苯;醚,例如二乙醚、甲基叔丁醚和二丁醚、乙二醇二甲醚和二甘醇二甲醚、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃和二噁烷;酮,例如丙酮、甲基乙基酮、甲基异丙基酮和甲基异丁基酮;酯,例如乙酸甲酯、乙酸乙酯和乙酸丁酯;腈,例如乙腈、丙腈和丁腈;醇,例如甲醇、乙醇、丙醇、异丙醇、丁醇、叔丁醇;酰胺,例如二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺和N-甲基吡咯烷酮以及二甲基亚砷、四亚甲基砷和六甲基磷酰胺和DMPU。

[0205] 在本发明方法中,反应温度可在相对宽的范围内变化。一般而言,使用的温度为-50℃至250℃,优选温度在-20℃至185℃之间。

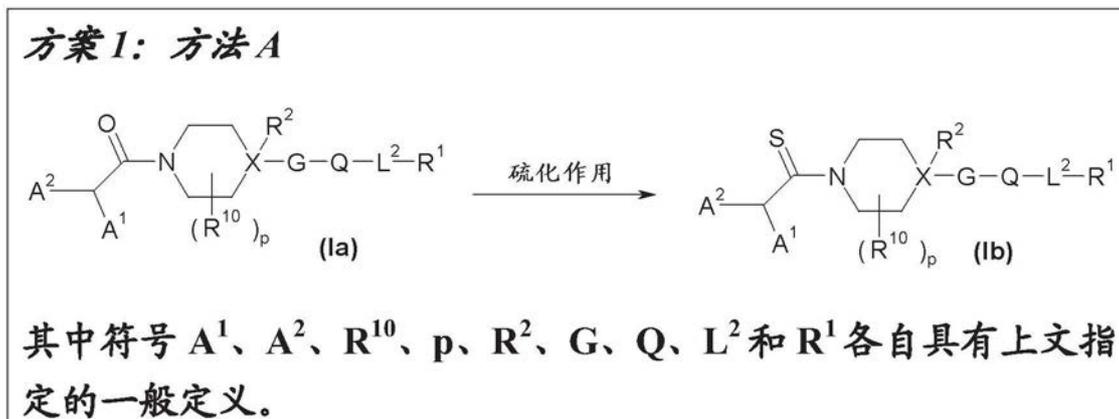
[0206] 反应时间随反应规模和反应温度而变化,但通常在几分钟至48小时之间。

[0207] 本发明方法通常在标准压力下进行。但是,也可在加压或减压下进行。

[0208] 为实施本发明方法,每种情况下所需的起始原料通常以大约等摩尔的量使用。但是,每种情况下也可以以较大过量的量使用其中一种组分。

[0209] 方法A

[0210]



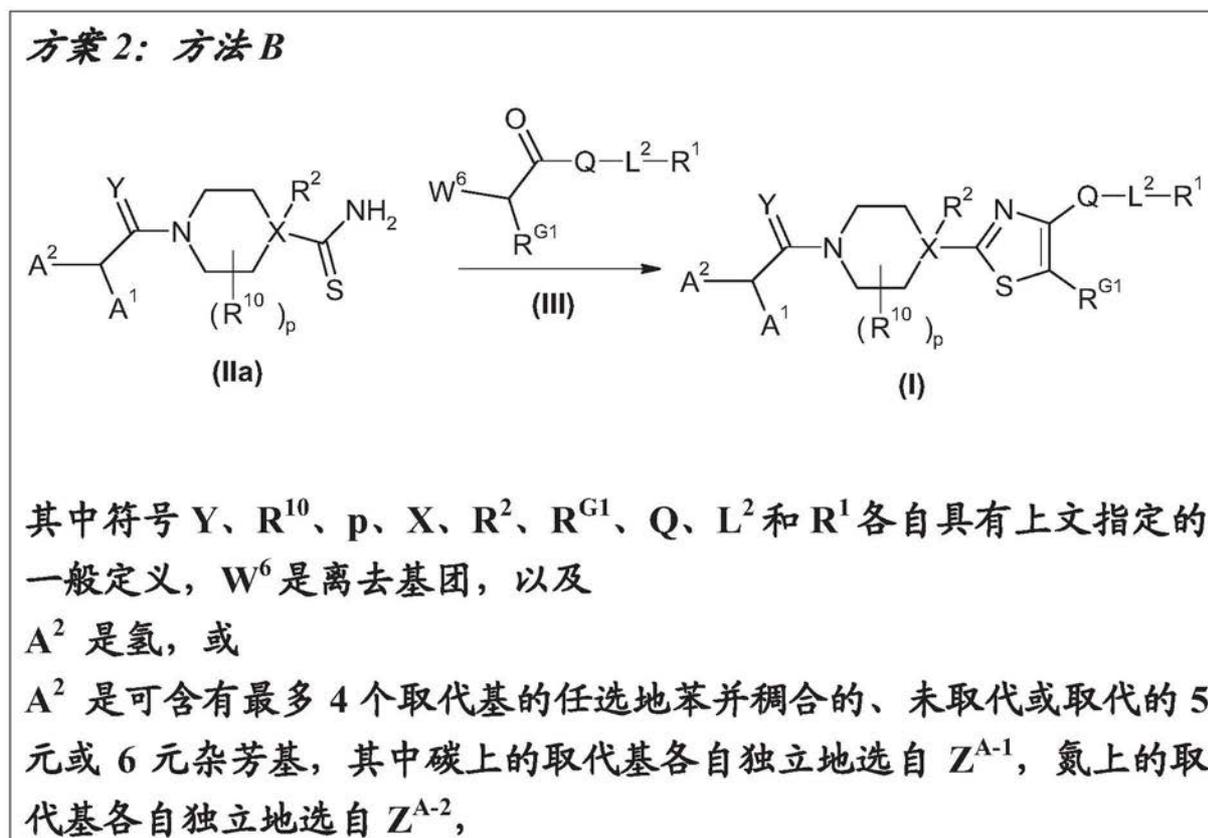
[0211] 通过文献中记载的方法可将酰胺 (Ia) 转化为相应的硫代酰胺 (Ib) (例如 Bioorganic&Medicinal Chemistry Letters, 2009, 19 (2), 462-468) (方法A, 方案1)。这涉及将式 (Ia) 的化合物通常与五硫化磷或2,4-双(4-甲氧基苯基)-1,3-二硫杂-2,4-二磷烷2,4-二硫化物(劳韦森试剂(Lawesson's reagent))反应。

[0212] 本发明的方法A优选使用一种或多种稀释剂进行。优选的溶剂是甲苯、四氢呋喃、1,4-二噁烷和1,2-二甲氧基乙烷。

[0213] 反应终止后,通过一种常规分离技术将化合物 (Ib) 从反应混合物中分离。如果需要,通过重结晶或色谱法纯化化合物。

[0214] 方法B

[0215]



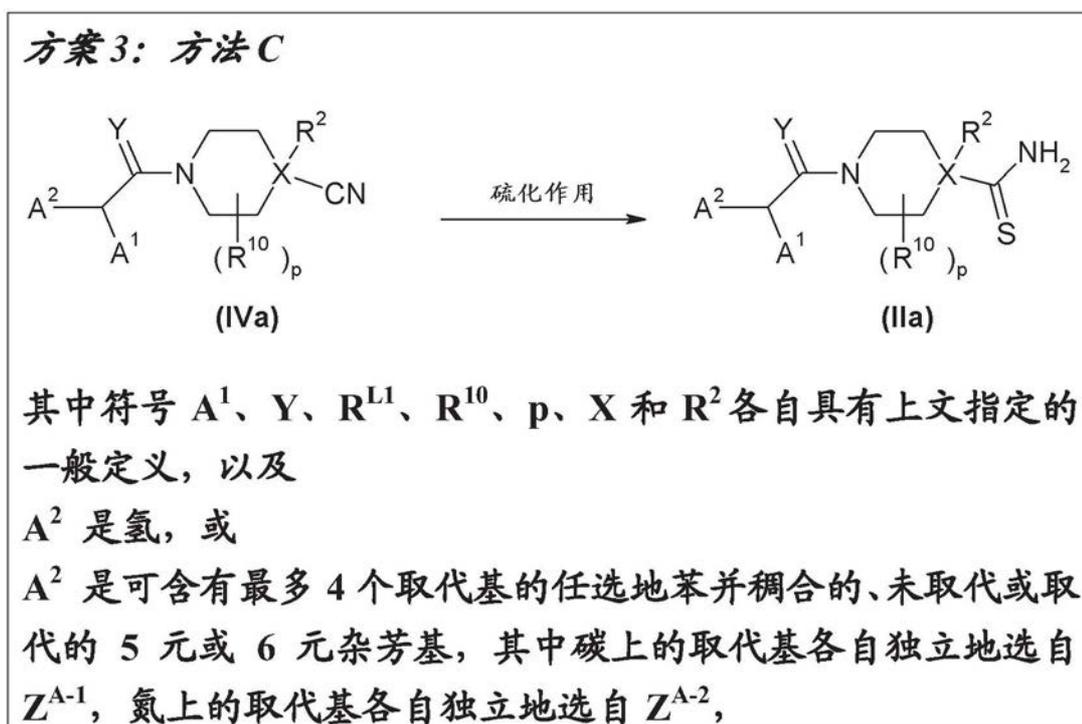
[0216] 方案2(方法B)示出了由相应的式(IIa)的硫代酰胺制备式(I)化合物的一种方法。

[0217] 通过文献中记载的Hantzsch噻唑合成法在式(III)化合物的存在下将式(IIa)的硫代酰胺转化为式(I)化合物(Organic&Biomolecular Chemistry,2012,10,1093-1101; Journal of Medicinal Chemistry,1991,34,600-605)。

[0218] 可使用类似于文献详细记载的方法合成具有通式(III)的化合物(例如参见WO 2008/013925或WO 2013/098229)。

[0219] 反应终止后,通过一种常规分离技术将化合物(I)从反应混合物中分离。如果需要,通过重结晶或色谱法纯化化合物,或者,如果需要,化合物也可用于下一步骤而不经预先纯化。

[0220] 方法C

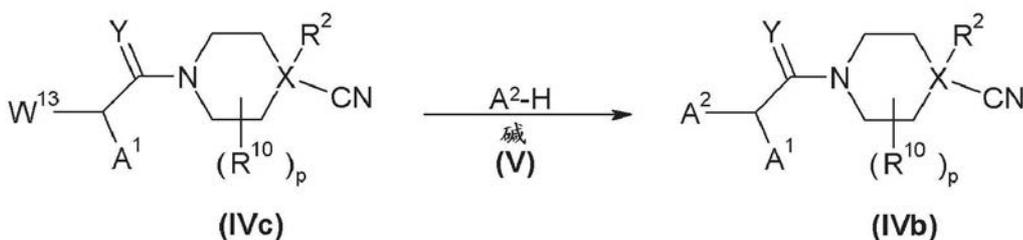


[0222] 可通过硫化作用将式(IVa)的腈转化为相应的硫代酰胺(IIa)(方法C,方案3)。该反应可在文献中记载的合适的反应条件下进行(例如参见Synlett,2009,2338-2340; Synthesis,2006,224-226;Synlett,2011,2807-2810;EP696581),它涉及将式(IVa)的化合物在硫化试剂(如硫化氢或其二硫化盐)的存在下与碱金属或氨反应,并且如果必要,在酸或碱的存在下反应。

[0223] 此外,可先将式(IVa)的腈在酸性或碱性条件(例如,用氢氧化钠、氢氧化钾或氢氧化锂水溶液,或用氯化氢水溶液)下水解为相应的酰胺,然后在合适的与方法A类似的硫化条件下转化为通式(IIa)的硫代酰胺。

[0224] 反应终止后,通过一种常规分离技术将化合物(IIa)从反应混合物中分离。如果需要,通过重结晶或色谱法纯化化合物。

[0225] 方法D

方案4: 方法D

[0226]

其中符号 A^1 、 Y 、 R^{L1} 、 R^{10} 、 p 、 X 和 R^2 各自具有上文指定的一般定义, 以及

W^{13} 是离去基团, 以及

A^2 是可含有最多 4 个取代基的任选地苯并稠合的、未取代或取代的 5 元或 6 元杂芳基, 其中碳上的取代基各自独立地选自 Z^{A-1} , 氮上的取代基各自独立地选自 Z^{A-2} ,

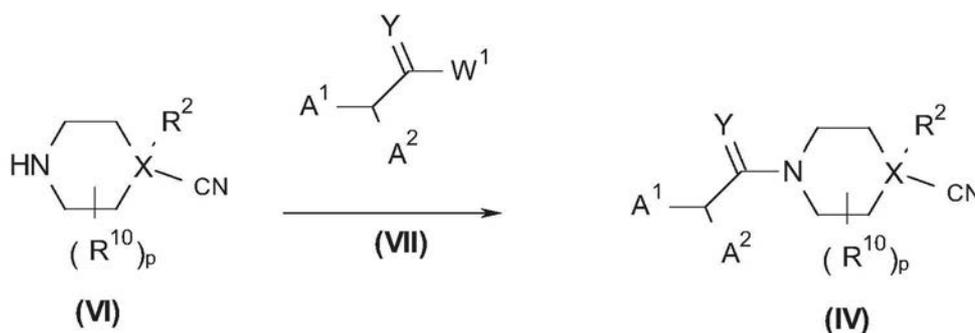
[0227] 通常, 可由相应的带有用于取代反应的合适的离去基团 W^{13} 的化合物 (IVc) 与底物 (例如 A^2-H (V), 其中 A^2 如上所定义且 H 是氢) 制备式 (IVb) 的化合物 (参见方案 4, 方法 D)。

[0228] 对于取代反应, 相对于通式 (IVc) 的起始物料, 至少使用一当量的碱 (如氢氧化钠、碳酸钾) 或除酸剂。

[0229] 反应终止后, 通过一种常规分离技术将化合物 (IVb) 从反应混合物中分离。如果需要, 通过重结晶或色谱法纯化化合物。

[0230] 方法E

[0231]

方案5: 方法E

[0232]

其中符号 A^1 、 A^2 、 Y 、 R^{L1} 、 R^{10} 、 p 、 X 和 R^2 各自具有上文指定的一般定义, W^1 是 F、Cl 或 OH

[0233] 方案5(方法E)示出了由相应的化合物(VI)和化合物(VII)制备式(IV)化合物的一种方法。

[0234] 可通过具有相应的通式(VI)的化合物与通式(VII)的底物(其中 W^1 是氯或氟)的偶联反应任选地在除酸剂/碱的存在下以类似于文献中记载的方法合成具有通式(IV)的化合物(例如参见W02008091594),

[0235] 相对于通式(VI)的起始物料,至少使用一当量的除酸剂/碱(如Hünig碱、三乙胺或市售的聚合除酸剂)。如果起始物料是盐,需要至少两当量的除酸剂。

[0236] 或者,也可由相应的式(VI)化合物与式(VII)的底物(其中 W^1 是氢)在偶联剂的存在下以类似于文献中记载的方法合成式(IV)的化合物(例如Tetrahedron,2005,61,10827-10852及其中引用的文献)。

[0237] 合适的偶联剂为,例如肽偶联剂(如与4-二甲基氨基吡啶混合的N-(3-二甲基氨基丙基)-N'-乙基碳二亚胺、与1-羟基苯并三唑混合的N-(3-二甲基氨基丙基)-N'-乙基碳二亚胺、溴化三吡咯烷基磷六氟磷酸盐、0-(7-氮杂苯并三唑-1-基)-N,N',N'-四甲基脲六氟磷酸盐等)。

[0238] 式(VII)化合物是市售的或可由文献中记载的方法制备(参见例如W02008013925、W02008091580、W02007014290和W02008091594)。

[0239] 式(VI)化合物是市售的或可通过类似于文献中记载的方法合成(例如Polish Journal of Chemistry,1988,62,451-5;W02012045124)。

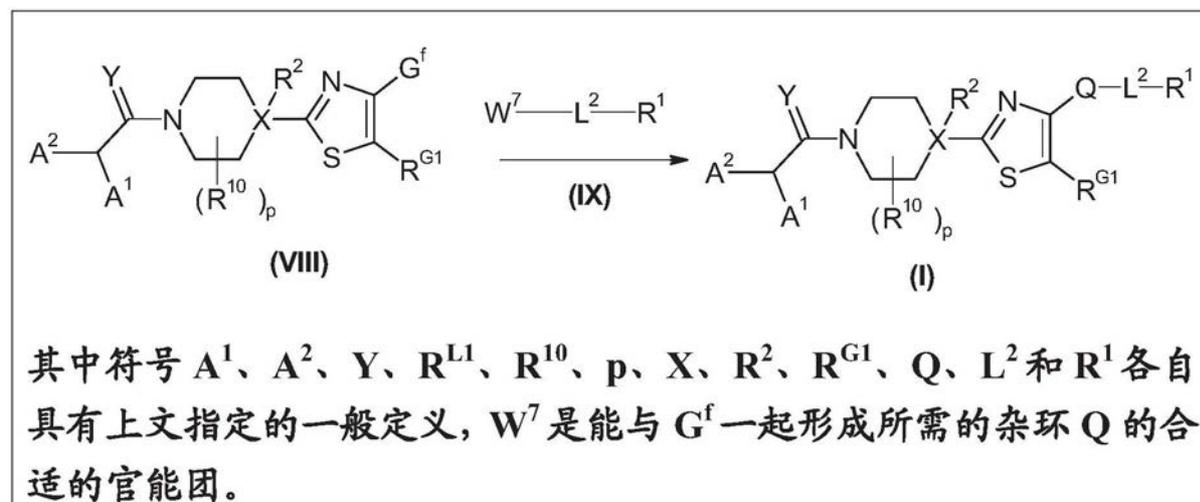
[0240] 反应终止后,通过一种常规分离技术将化合物(IV)从反应混合物中分离。如果需要,通过重结晶或色谱法纯化化合物。

[0241] 方法F

[0242]

方案6: 方法F

[0243]



[0244] 通常,还可由相应的具有合适的官能团 G^f 和 W^7 的化合物(VIII)和(IX)制备式(I)化合物(方案6,方法F)。有很多关于制备杂环的文献方法(参见W02008/013622; Comprehensive Heterocyclic Chemistry,第4-6卷,编者:A.R.Katritzky和C.W.Rees,

Pergamon出版社,纽约,1984;Comprehensive Heterocyclic Chemistry II,第2-4卷,编者:A.R.Katritzky,C.W.Rees和E.F.Scriven,Pergamon出版社,纽约,1996;The Chemistry of Heterocyclic Compounds,编者:E.C.Taylor,Wiley,纽约;Rodd's Chemistry of Carbon Compounds,第2-4卷,Elsevier,纽约;Synthesis,1982,6,508-509;Tetrahedron,2000,56,1057-1064)。

[0245] 具有通式 (IX) 的化合物 (如苯乙烯) 通常是市售的或可通过文献中记载的方法制备。

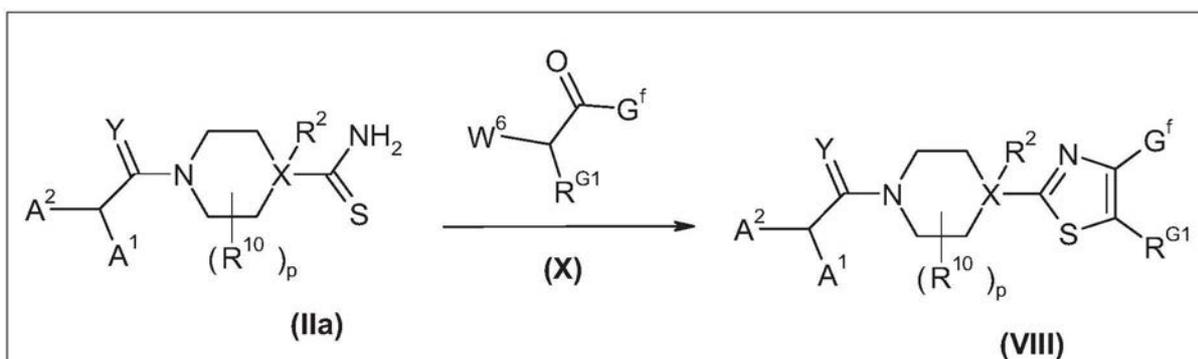
[0246] 反应终止后,通过一种常规分离技术将化合物 (I) 从反应混合物中分离。如果需要,通过重结晶或色谱法纯化化合物。

[0247] 方法G

[0248]

方案7: 方法G

[0249]



其中符号 A¹、Y、R^{L1}、R¹⁰、p、X、R²、R^{G1} 和 G^f 各自具有上文指定的一般定义, W⁶ 是离去基团以及

A² 是氢, 或

A² 是可含有最多 4 个取代基的任选地苯并稠合的、未取代或取代的 5 元或 6 元杂芳基, 其中碳上的取代基各自独立地选自 Z^{A-1}, 氮上的取代基各自独立地选自 Z^{A-2},

[0250] 方案7 (方法G) 示出了一种由相应的式 (IIa) 的硫代酰胺制备式 (VIII) 化合物的方法。

[0251] 通过类似于方法B (方案2) 的Hantzsch噻唑合成法在式 (X) 化合物的存在下将式 (IIa) 的硫代酰胺转化为式 (VIII) 的化合物。

[0252] 具有通式 (X) 的化合物可通过类似于文献中详细记载的方法合成 (例如参见W0 2008013925)。

[0253] 反应终止后,通过一种常规分离技术将化合物 (VIII) 从反应混合物中分离。如果需要,通过重结晶或色谱法纯化化合物,或者,如果需要,化合物也可用于下一步骤而不经

预先纯化。

[0254] 应了解,通过化学合成领域技术人员通常使用的合成方法,在一个或多个步骤中,在合成的任何合适的阶段,取代基 R^2 可从一种取代基定义转化为另一种,如上文所指定的。例如,可将带有作为 R^2 的酯的中间体或终产物在碱或酸的水溶液的存在下皂化为其相应的羧酸,然后再通过酰胺化或酯化作用转化为酰胺或另一种酯。

[0255] 此外,还应了解,上文描述的用于制备式(I)的化合物的某些试剂和反应条件可能与中间体化合物中存在的特定官能团不相容。在这些情况下,向合成中引入保护/脱保护顺序或官能团的相互转化有助于得到需要的产物。保护基的使用和选择对化学合成领域的技术人员是显而易见的(例如参见“Protective Groups in Organic Synthesis”;第三版;494-653,及其中引用的文献)。本领域技术人员应了解,在某些情况下,在将各个方案中示出的给定试剂加入后,为了完成式(I)的化合物的合成有必要进行额外的未具体描述的例行合成步骤。本领域技术人员还应了解,为了制备式(I)的化合物,可能有必要以与具体显示的默示顺序不同的顺序来进行以上方案中所示的步骤的组合。

[0256] 通过常规方法进行后处理。如果需要,通过重结晶或色谱法纯化化合物。

[0257] 本发明还涉及一种防治不想要的微生物的方法,其特征在于将本发明的杂芳基哌啶和杂芳基哌嗪衍生物施用至微生物和/或其生境。

[0258] 本发明进一步涉及用至少一种本发明的杂芳基哌啶和杂芳基哌嗪衍生物处理过的种子。

[0259] 最后,本发明提供一种通过使用至少一种本发明的杂芳基哌啶和杂芳基哌嗪衍生物处理过的种子来保护种子免受不想要的微生物侵害的方法。

[0260] 本发明的物质在作物保护和材料保护中具有有效的杀微生物活性并可用于防治不想要的微生物,如真菌和细菌。

[0261] 本发明的式(I)的哌啶羧酸衍生物具有非常好的杀真菌性能并可用于作物保护,例如用于防治根肿菌(Plasmodiophoromycetes)、卵菌(Oomycetes)、壶菌(Chytridiomycetes)、接合菌(Zygomycetes)、子囊菌(Ascomycetes)、担子菌(Basidiomycetes)及半知菌(Deuteromycetes)。

[0262] 杀细菌剂可用在作物保护中,例如,用于防治假单胞菌(Pseudomonadaceae)、根瘤菌(Rhizobiaceae)、肠杆菌(Enterobacteriaceae)、棒杆菌(Corynebacteriaceae)及链霉菌(Streptomyetaceae)。

[0263] 本发明的杀真菌组合物可用于治疗性或预防性地防治植物致病真菌。因此,本发明还涉及通过使用本发明的活性成分或组合物——将其施用于种子、植物或植物部位、果实或植物生长的土壤——用于防治植物致病真菌的治疗性和预防性方法。

[0264] 在作物保护中用于防治植物致病真菌的本发明组合物含有有效但非植物毒性量的本发明活性成分。“有效但非植物毒性量”是指本发明组合物的量足够以令人满意的方式防治植物真菌病害或完全消除真菌病害,与此同时不会引起任何显著的植物毒性症状。一般而言,该施用率可以在相对宽的范围内变化。其取决于几个因素,例如待防治的菌类、植物、气候条件及本发明组合物的成分。

[0265] 根据本发明可对所有植物及植物部位进行处理。在本说明书中,植物应理解为是指所有植物及植物种群,例如需要的和不需要的野生植物或作物植物(包括天然存在的作

物植物)。作物植物可以是可通过常规育种和优化方法或通过生物技术和遗传工程方法或这些方法的组合得到的植物,包括转基因植物,也包括受植物育种权(plant breeders' rights)保护或不受其保护的植物栽培种。植物部位应理解为是指植物的所有地上和地下的部位和器官,例如芽、叶、花和根,其实例包括叶、针叶、茎、干、花、子实体、果实、种子、根、块茎和根茎。植物部位还包括采收物及无性和有性繁殖物,例如插枝、块茎、根茎、分枝和种子。

[0266] 组合物/制剂

[0267] 本发明还涉及用于防治有害微生物——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但非植物毒性量的本发明的活性成分。它们优选为包含农业上合适的助剂、溶剂、载体、表面活性剂或填充剂的杀真菌组合物。

[0268] 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功效,与未处理的植物(100%)相比优选减少25-50%,与未处理的植物(100%)相比更优选减少40-79%;甚至更优选地,有害微生物的感染被完全抑制(减少70-100%)。该防治可以是治疗性的,即用于处理已被感染的植物,或者是保护性的,即用于保护未被感染的植物。

[0269] “有效但非植物毒性量”是指本发明组合物的量足够以令人满意的方式防治植物真菌病害或完全消除真菌病害,与此同时不会引起任何显著的植物毒性症状。一般而言,该施用率可以在相对宽的范围变化。其取决于几个因素,例如待防治的真菌、植物、气候条件及本发明组合物的成分。

[0270] 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。优选的溶剂选自酮类,例如甲基异丁基酮和环己基酮;酰胺类,例如二甲基甲酰胺;链烷羧酸酰胺类,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;以及芳香烃类,例如二甲苯、Solvesso™;矿物油类,例如石油溶剂油(white spirit)、石油、烷基苯和锭子油;以及酯类,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、柠檬酸三正丁酯和邻苯二甲酸二正丁酯;以及醇类,例如苕醇和1-甲氧基-2-丙醇。

[0271] 根据本发明,载体为天然的或合成的、有机的或无机的物质,将活性成分与之混合或组合以获得更好的施用性,特别是用于施用至植物或植物部位或种子时。所述载体(其可为固体或液体)通常是惰性的且应适用于农业使用。

[0272] 有用的固体或液体载体包括:例如铵盐和天然矿石粉末(例如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、绿坡缕石、蒙脱土或硅藻土)、合成矿石粉末(例如细分散的二氧化硅、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。

[0273] 合适的固体填料和载体包括无机颗粒,例如平均粒径为0.005-20 μm 、优选0.02-10 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。

[0274] 用于颗粒剂的有用的固体载体包括:例如粉碎并分级的天然岩石,例如方解石、大

理石、浮石、海泡石、白云石,以及无机和有机粉末的合成颗粒,以及有机材料例如木屑、椰壳、玉米穗轴及烟草茎的颗粒。

[0275] 有用的液化的气态填充剂或载体是那些在标准温度及标准压力下为气态的液体,例如气溶胶喷射剂,如卤代烃,以及丁烷、丙烷、氮气和二氧化碳。

[0276] 在所述制剂中,可使用增粘剂(例如羧甲基纤维素),以及粉末、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。

[0277] 如果所使用的填充剂是水,则还可使用例如有机溶剂作为助溶剂。有用的液体溶剂主要为:芳香族化合物如二甲苯、甲苯或烷基萘;氯代芳香族化合物和氯代脂肪族烃,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;强极性溶剂如二甲基甲酰胺和二甲基亚砷;以及水。

[0278] 合适的表面活性剂(佐剂、乳化剂、分散剂、保护性胶体、润湿剂和粘合剂)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乙二醇醚、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-乙氧基化物和-乙氧基化物和-丙氧基化物。其他实例为天然的和合成的水溶性聚合物,如木素磺酸盐、明胶、阿拉伯胶、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。如果所述活性成分之一和/或所述惰性载体之一不溶于水且施用在水中进行时,则表面活性剂的存在是必要的。表面活性剂的比例占本发明组合物的5-40重量%。

[0279] 可使用染料如无机颜料,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;以及微量营养物,例如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐和锌盐。

[0280] 可存在于所述制剂中的消泡剂包括例如硅酮乳液、长链的醇类、脂肪酸及其盐,以及含氟有机物及其混合物。

[0281] 增稠剂的实例为多糖如黄原胶或硅酸镁铝(veegum);硅酸盐,例如绿坡缕石、膨润土以及细颗粒二氧化硅。

[0282] 如果合适,也可存在其他额外的组分,例如保护性胶体、粘合剂(binder)、粘着剂(adhesive)、增稠剂、触变物质、渗透剂、稳定剂、螯合剂(sequestant)、络合剂。通常,所述活性成分可与任何通常用于制剂目的的固体或液体添加剂组合。

[0283] 根据其特定的物理和/或化学性质,本发明的活性成分或组合物可以以其制剂形式或由其制备的使用形式施用,所述使用形式例如气溶胶、胶囊悬浮剂、冷雾浓缩剂(cold-fogging concentrate)、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 concentrate)、即用型溶液、可撒粉的粉剂、可乳化的浓缩剂、水包油乳

剂、油包水乳剂、大颗粒剂、微颗粒剂、油分散性粉末剂、油混溶性流动浓缩剂、油混溶性液体、气剂(在压力下)、产气产品、泡沫剂、糊剂、杀虫剂包衣的种子、悬浮浓缩剂、悬乳浓缩剂、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和水分散性粉剂,可湿性粉剂、经活性成分浸渍的天然产物及合成物质,以及聚合物和种子包衣材料中的微胶囊,以及ULV冷雾和热雾制剂。

[0284] 本发明的组合物不仅包括即用型并可通过合适装置施用至植物或种子的制剂,还包括在使用之前必须用水稀释的市售浓缩剂。常规施用为例如在水中稀释后喷洒所得喷雾液体、在油中稀释后施用、不经稀释直接施用、用颗粒剂处理种子或土壤施用。

[0285] 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%的活性成分,最优选10至70重量%。对于特殊施用,例如对于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。

[0286] 由市售制剂制备的施用形式中的活性成分的含量可在宽范围内变化。施用形式中的活性成分的浓度通常为0.000001至95重量%,优选0.0001至2重量%。

[0287] 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规填充剂、溶剂或稀释剂、佐剂、乳化剂、分散剂和/或粘合剂或固定剂、润湿剂、疏水剂,如果合适还有干燥剂和UV稳定剂,以及如果合适还有染料和颜料、消泡剂、防腐剂、无机和有机增稠剂、粘着剂、赤霉素以及其他加工助剂和水混合。根据待制备的制剂种类需要其他加工步骤,如湿法研磨,干法研磨及制粒。

[0288] 本发明的活性成分可以自身形式或其(市售)制剂形式以及由这些制剂和其他(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)活性成分为例如杀昆虫剂、引诱剂、杀菌剂(sterilant)、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。

[0289] 本发明使用活性成分或组合物对植物和植物部位的处理可通过常规处理方法直接进行或通过作用于其周围环境、生境或存贮空间而进行,所述常规处理方法为例如通过浸渍、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,在繁殖材料的情况下,特别是对于种子,还可通过干种处理、湿种处理、浆液处理、结壳、包被一层或多层包衣等。还可通过超低容量法施用该活性成分,或将活性成分制剂或活性成分本身注射到土壤中。

[0290] 植物/作物保护

[0291] 本发明的活性成分或组合物具有有效的杀微生物活性并可用于在作物保护和材料保护中防治不想要的微生物,如真菌和细菌。

[0292] 本发明还涉及防治不想要的微生物的方法,其特征在于,将本发明的活性成分施用于植物致病真菌、植物致病细菌和/或它们的生境。

[0293] 杀真菌剂可在作物保护中用于防治植物致病真菌。它们的特征在于抵抗广谱植物致病真菌(包括土壤传播性病原菌,其特别为根肿菌纲(Plasmodiophoromycete)、霜霉纲(Peronosporomycete)(又名卵菌纲(Oomycete))、壶菌纲(Chytridiomycete)、接合菌纲(Zygomycete)、子囊菌纲(Ascomycete)、担子菌纲(Basidiomycete)和半知菌纲(Deuteromycete)(又名不完全菌纲(Fungi imperfecti))的成员)的显著功效。一些杀真菌

剂具有内吸活性,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,它们适用于对抗特别是感染木材或植物根部的真菌。

[0294] 杀菌剂在作物保护中可用于防治假单孢菌科 (*Pseudomonadaceae*)、根瘤菌科 (*Rhizobiaceae*)、肠杆菌科 (*Enterobacteriaceae*)、棒杆菌科 (*Corynebacteriaceae*) 以及链霉菌科 (*Streptomycetaceae*)。

[0295] 可以根据本发明处理的真菌病害的病原体的非限制性实例包括:

[0296] 由白粉病病原体引起的病害,例如,布氏白粉菌属 (*Blumeria*) 种,例如禾本科布氏白粉菌 (*Blumeria graminis*);叉丝单囊壳属 (*Podosphaera*) 种,例如白叉丝单囊壳 (*Podosphaera leucotricha*);单囊壳属 (*Sphaerotheca*) 种,例如凤仙花单囊壳 (*Sphaerotheca fuliginea*);钩丝壳属 (*Uncinula*) 种,例如葡萄钩丝壳 (*Uncinula necator*);

[0297] 由锈病病原体引起的病害,例如,胶锈菌属 (*Gymnosporangium*) 种,例如褐色胶锈菌 (*Gymnosporangium sabinae*);驼孢锈属 (*Hemileia*) 种,例如咖啡驼孢锈菌 (*Hemileia vastatrix*);层锈菌属 (*Phakopsora*) 种,例如豆薯层锈菌 (*Phakopsora pachyrhizi*) 和山马蝗层锈菌 (*Phakopsora meibomia*);柄锈菌属 (*Puccinia*) 种,例如隐匿柄锈菌 (*Puccinia recondite*)、小麦叶锈菌 (*P. tritricina*)、小麦秆锈菌 (*P. graminis*) 或小麦条锈菌 (*P. striiformis*);单胞锈菌属 (*Uromyces*) 种,例如疣顶单胞锈菌 (*Uromyces appendiculatus*);

[0298] 由卵菌纲 (*Oomycete*) 类病原体引起的病害,例如,白锈菌属 (*Albugo*) 种,例如白锈菌 (*Albugo candida*);盘霜霉属 (*Bremia*) 种,例如莴苣盘霜霉 (*Bremia lactucae*);霜霉属 (*Peronospora*) 种,例如豌豆霜霉 (*Peronospora pisi*) 或十字花科霜霉 (*P. brassicae*);疫霉属 (*Phytophthora*) 种,例如致病疫霉 (*Phytophthora infestans*);轴霜霉属 (*Plasmopara*) 种,例如葡萄生轴霜霉 (*Plasmopara viticola*);假霜霉属 (*Pseudoperonospora*) 种,例如草假霜霉 (*Pseudoperonospora humuli*) 或古巴假霜霉 (*Pseudoperonospora cubensis*);腐霉属 (*Pythium*) 种,例如终极腐霉 (*Pythium ultimum*);

[0299] 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,链格孢属 (*Alternaria*) 种,例如早疫病链格孢 (*Alternaria solani*);尾孢属 (*Cercospora*) 种,例如苜蓿生尾孢 (*Cercospora beticola*);枝孢属 (*Cladosporium*) 种,例如黄瓜枝孢 (*Cladosporium cucumerinum*);旋孢腔菌属 (*Cochliobolus*) 种,例如禾旋孢腔菌 (*Cochliobolus sativus*) (分生孢子形式:内脐蠕孢属 (*Drechslera*, 又名长蠕孢菌 (*Helminthosporium*))、宫部旋孢霉 (*Cochliobolus miyabeanus*);炭疽菌属 (*Colletotrichum*) 种,例如菜豆炭疽菌 (*Colletotrichum lindemuthianum*);锈斑病菌属 (*Cycloconium*) 种,例如孔雀斑病 (*Cycloconium oleaginum*);间座壳属 (*Diaporthe*) 种,例如柑桔间座壳 (*Diaporthe citri*);痂囊腔菌属 (*Elsinoe*) 种,例如柑桔痂囊腔菌 (*Elsinoe fawcettii*);盘长孢属 (*Gloeosporium*) 种,例如悦色盘长孢 (*Gloeosporium laeticolor*);小丛壳属 (*Glomerella*) 种,例如围小丛壳 (*Glomerella cingulata*);球座菌属 (*Guignardia*) 种,例如葡萄球座菌 (*Guignardia bidwelli*);小球腔菌属 (*Leptosphaeria*) 种,例如斑污小球腔菌 (*Leptosphaeria maculans*)、颖枯小球腔菌 (*Leptosphaeria nodorum*);大毁壳属 (*Magnaporthe*) 种,例如灰色大毁壳 (*Magnaporthe grisea*);微座孢属

(*Microdochium*) 种,例如雪霉微座孢 (*Microdochium nivale*);球腔菌属 (*Mycosphaerella*) 种,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*);壳针孢属 (*Phaeosphaeria*) 种,例如颖枯壳针孢 (*Phaeosphaeria nodorum*);核腔菌属 (*Pyrenophora*) 种,例如圆核腔菌 (*Pyrenophora teres*)、偃麦草核腔菌 (*Pyrenophora tritici-repentis*);柱隔孢属 (*Ramularia*) 种,例如辛加柱隔孢 (*Ramularia collo-cygni*)、白斑柱隔孢 (*Ramularia areola*);喙孢属 (*Rhynchosporium*) 种,例如黑麦喙孢 (*Rhynchosporium secalis*);针孢属 (*Septoria*) 种,例如芹菜小壳针孢 (*Septoria apii*)、番茄壳针孢 (*Septoria lycopersii*);核瑚菌属 (*Typhula*) 种,例如肉孢核瑚菌 (*Typhula incarnata*);黑星菌属 (*Venturia*) 种,例如苹果黑星病菌 (*Venturia inaequalis*);

[0300] 由下述病原体引起的根和茎的病害:例如,伏革菌属 (*Corticium*) 种,例如禾伏革菌 (*Corticium graminearum*);镰孢属 (*Fusarium*) 种,例如尖镰孢 (*Fusarium oxysporum*);顶囊壳属 (*Gaeumannomyces*) 种,例如禾顶囊壳 (*Gaeumannomyces graminis*);丝核菌属 (*Rhizoctonia*) 种,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;例如由稻腐小核菌 (*Sclerotium oryzae*) 引起的小核菌 (*Sclerotium*) 属病害;Tapesia 种,例如 *Tapesia acuformis*;根串珠霉属 (*Thielaviopsis*) 种,例如根串珠霉 (*Thielaviopsis basicola*);

[0301] 由下述病原体引起的肉穗花序和圆锥花序病害(包括玉米穗轴):例如,链格孢属 (*Alternaria*) 种,例如链格孢属 (*Alternaria* spp.);曲霉属 (*Aspergillus*) 种,例如黄曲霉 (*Aspergillus flavus*);枝孢属 (*Cladosporium*) 种,例如芽枝状枝孢 (*Cladosporium cladosporioides*);麦角菌属 (*Claviceps*) 种,例如麦角菌 (*Claviceps purpurea*);镰孢属 (*Fusarium*) 种,例如黄色镰孢 (*Fusarium culmorum*);赤霉属 (*Gibberella*) 种,例如玉蜀黍赤霉 (*Gibberella zeae*);小画线壳属 (*Monographella*) 种,例如雪腐小画线壳 (*Monographella nivalis*);壳针孢属 (*Septoria*) 种,例如颖枯壳针孢 (*Septoria nodorum*);

[0302] 由黑粉菌引起的病害,例如,轴黑粉菌属 (*Sphacelotheca*) 种,例如丝孢堆黑粉菌 (*Sphacelotheca reiliana*);腥黑粉菌属 (*Tilletia*) 种,例如小麦网腥黑粉菌 (*Tilletia caries*)、小麦矮腥黑粉菌 (*T.controversa*);条黑粉菌属 (*Urocystis*) 种,例如隐条黑粉菌 (*Urocystis occulta*);黑粉菌属 (*Ustilago*) 种,例如裸黑粉菌 (*Ustilago nuda*)、小麦散黑粉菌 (*U.nuda tritici*);

[0303] 由下列病原体导致的果实腐烂:例如,曲霉属 (*Aspergillus*) 种,例如黄曲霉 (*Aspergillus flavus*);葡萄孢属 (*Botrytis*) 种,例如灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*);青霉属 (*Penicillium*) 种,例如扩展青霉 (*Penicillium expansum*) 和产紫青霉 (*P.purpurogenum*);核盘菌属 (*Sclerotinia*) 种,例如核盘菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*);轮枝孢属 (*Verticillium*) 种,例如黑白轮枝菌 (*Verticillium albo-atrum*);

[0304] 由下述病原体引起的种子和土壤传播的腐烂、发霉、萎蔫、腐坏和立枯病:例如,链格孢属 (*Alternaria*) 种,例如芸薹链格孢 (*Alternaria brassicicola*);丝囊霉属 (*Aphanomyces*) 种,例如根腐丝囊霉 (*Aphanomyces euteiches*);壳二孢属 (*Ascochyta*) 种,例如兵豆壳二孢 (*Ascochyta lentis*);曲霉属 (*Aspergillus*) 种,例如黄曲霉 (*Aspergillus*

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

[0305] 由下述病原体引起的癌性病害、菌瘿和扫帚病 (witches' broom): 例如, 丛赤壳属 (*Nectria*) 种, 例如仁果干癌丛赤壳菌 (*Nectria galligena*);

[0306] 由下述病原体引起的萎缩病害: 例如, 链核盘菌属 (*Monilinia*) 种, 例如核果链核盘菌 (*Monilinia laxa*);

[0307] 由下述病原体引起的叶疱病或卷叶病: 例如, 外担菌属 (*Exobasidium*) 种, 例如损坏外担菌 (*Exobasidium vexans*);

[0308] 外囊菌属 (*Taphrina*) 种, 例如畸形外囊菌 (*Taphrina deformans*);

[0309] 由下述病原体引起的木本植物退化病害: 例如, 例如由根霉格孢菌 (*Phaeoconiella chlamydospora*)、*Phaeoacremonium aleophilum* 和地中海孢孔菌 (*Fomitiporia mediterranea*) 引起的依科病 (*Esca*); 例如由葡萄藤顶枯菌 (*Eutypa lata*) 引起的葡萄顶枯病 (*Eutypa dyeback*); 例如由狭长孢灵芝 (*Ganoderma boninense*) 引起的灵芝属 (*Ganoderma*) 病害; 例如由木硬孔菌 (*Rigidoporus lignosus*) 引起的硬孔菌属 (*Rigidoporus*) 病害;

[0310] 由下述病原体引起的花和种子的病害: 例如, 葡萄孢属 (*Botrytis*) 种, 例如灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*);

[0311] 由下述病原体引起的植物块茎的病害: 例如, 丝核菌属 (*Rhizoctonia*) 种, 例如立枯丝核菌 (*Rhizoctonia solani*); 长蠕孢菌属 (*Helminthosporium*) 种, 例如茄病长蠕孢 (*Helminthosporium solani*);

[0312] 由下述病原体引起的根肿病害: 例如, 根肿菌属 (*Plasmodiophora*) 种, 例如云蕈根肿菌 (*Plasmodiophora brassicae*);

[0313] 由下述细菌性病原体引起的病害: 例如, 黄单胞菌属 (*Xanthomonas*) 种, 例如稻黄单胞菌白叶枯变种 (*Xanthomonas campestris* pv. *oryzae*); 假单胞菌属 (*Pseudomonas*) 种,

例如丁香假单胞菌黄瓜致病变种(*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*);欧文氏菌属(*Erwinia*)种,例如噬淀粉欧文氏菌(*Erwinia amylovora*)。

[0314] 可优选防治下列大豆病害:

[0315] 由下述病原体引起的叶、茎、荚和种子的真菌病害:例如,链格孢叶斑病(*Alternaria spec. atrans tenuissima*)、炭疽病(*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*)、褐斑病(大豆壳针孢(*Septoria glycines*))、大豆叶斑病和叶枯病(菊池尾孢(*Cercospora kikuchii*))、弃霉菌叶枯病(*Choanephora infundibulifera trispora* (又名))、疏毛核菌霉属叶斑病(*dactuliophora leaf spot*) (*Dactuliophora glycines*)、大豆霜霉病(东北霜霉(*Peronospora manshurica*))、德氏霉叶枯冰(*drechslera blight*) (*Drechslera glycini*)、蛙眼病(*frogeye leaf spot*) (大豆尾孢(*Cercospora sojina*))、小光壳属叶斑病(*leptosphaerulina leaf spot*) (三叶草小光壳(*Leptosphaerulina trifolii*))、叶点霉属叶斑病(*phyllostica leaf spot*) (大豆生叶点霉(*Phyllosticta sojaecola*))、荚和茎枯萎病(大豆拟茎点霉(*Phomopsis sojiae*))、白粉病(*powdery mildew*) (叉丝壳属白花蛇舌草(*Microsphaera diffusa*))、棘壳孢属叶斑病(*pyrenochaeta leaf spot*) (棘壳孢属糖胶(*Pyrenochaeta glycines*))、气生丝核菌(*rhizoctonia aerial*)、叶枯萎病及网状结构枯萎病(*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*))、疮痂病(大豆痂圆孢(*Sphaceloma glycines*));匍柄霉属叶枯病(匍柄霉(*Stemphylium botryosum*));靶斑病(山扁豆生棒孢(*Corynespora cassiicola*))。

[0316] 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 vasinfecra*))、荚和茎枯萎病(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(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、茎腐病和立枯病(立枯丝核菌(*Rhizoctonia solani*))、核盘菌茎腐病(核盘菌(*Sclerotinia sclerotiorum*))、核盘菌白绢病(*Sclerotinia rolfisii*)、根串珠霉根腐病(根串珠霉(*Thielaviopsis basicola*))。

[0317] 本发明的杀真菌组合物可用于治疗性或保护性/预防性防治植物致病真菌。因此,本发明还涉及用于防治植物致病真菌的治疗性和保护性方法,所述方法通过使用本发明的活性成分或组合物——将其施用至种子、植物或植物部位、果实或植物生长的土壤——进行。

[0318] 所述活性成分在防治植物病害所需的浓度下被植物良好地耐受,这一事实允许处

理植物的地上部分、繁殖材料和种子,以及土壤。

[0319] 根据本发明可处理所有的植物和植物部位。植物意指所有的植物和植物种群,例如需要和不需要的野生植物、栽培种和植物品种(不论是否受品种或植物育种者权的保护)。栽培种和植物品种可以是通过常规繁殖法和育种法(其可由一种或多种生物技术法进行辅助或补充,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、分子或遗传标记物),或通过生物工程和遗传工程的方法而获得的植物。植物部位意指植物的所有地上和地下部位和器官,例如芽、叶、花和根,例如叶、针叶、茎、枝、花、子实体、果实、种子,以及根、球茎和根茎。作物以及无性和有性繁殖材料,例如插条、球茎、根茎、分蘖和种子也属于植物部位。

[0320] 当本发明的活性成分被植物良好耐受、具有有利的温血动物毒性并被环境良好耐受时,其适用于保护植物和植物器官、提高采收产量、改善采收材料的质量。它们可被优先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一些发育阶段具有活性。

[0321] 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(田野)芥菜)和伊索比亚芥菜(*Brassica carinata*)、棕榈科种(例如油棕、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来自各种植物分类群的各种果实及蔬菜,例如蔷薇科种(*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*))、茶藨子科种(*Ribesioideae sp.*)、胡桃科种(*Juglandaceae sp.*)、桦木科种(*Betulaceae sp.*)、漆树科种(*Anacardiaceae sp.*)、壳斗科种(*Fagaceae sp.*)、桑科种(*Moraceae sp.*)、木犀科种(*Oleaceae sp.*) (如橄榄树)、猕猴桃科种(*Actinidaceae sp.*)、樟科种(*Lauraceae sp.*) (例如鳄梨、肉桂、樟脑)、芭蕉科种(*Musaceae sp.*) (例如香蕉树和香蕉种植园)、茜草科种(*Rubiaceae sp.*) (例如咖啡)、山茶科种(*Theaceae sp.*) (例如茶树)、梧桐科种(*Sterculiaceae sp.*)、芸香科种(*Rutaceae sp.*) (例如柠檬、橙、柑橘和葡萄柚)、茄科种(*Solanaceae sp.*) (例如番茄、马铃薯、胡椒、辣椒、茄子和烟草)、百合科种(*Liliaceae sp.*)、菊科种(*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*))、伞形科种(*Umbelliferae sp.*) (例如胡萝卜、欧芹、芹菜和块根芹)、葫芦科种(*Cucurbitaceae sp.*) (例如黄瓜--包括小黄瓜、南瓜、西瓜、葫芦类和甜瓜类)、葱科种(*Alliaceae sp.*) (例如韭类和洋葱类)、十字花科种(*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)、豆科种(*Leguminosae sp.*) (例如花生、豌豆类、扁豆类和菜豆类--例如菜豆(*common beans*)和蚕豆(*broad beans*))、藜科种(*Chenopodiaceae sp.*) (例如瑞士甜菜(*Swiss chard*)、饲用甜菜、菠菜、甜菜根)、亚麻科种(*Linaceae sp.*) (例如麻)、大麻科种(*Cannabaceae sp.*) (例如大麻)、锦葵科种(*Malvaceae sp.*) (例如黄秋葵、可可)、罂粟科种(*Papaveraceae*) (例如罂粟)、天门冬科(*Asparagaceae*) (例如芦笋);园艺和森林中的有用植物和观赏植物,如草皮、草坪、青草和甜叶菊(*Stevia rebaudiana*),以及每个情况下,这些植物的遗传修饰的品种。

[0322] 植物生长调节

[0323] 有些情况下,本发明化合物还可在特定浓度和施用率下用作除草剂、安全剂、生长调节剂或改进植物性能的制剂,或用作杀微生物剂,例如用作杀真菌剂、抗霉菌剂、杀细菌剂、杀病毒剂(包括抵抗类病毒的组合物)或用作抵抗MLO(支原体样微生物)和RLO(立克次体样微生物)的组合物。如果合适,它们也可用作合成其他活性成分的中间体或前体。

[0324] 本发明的活性成分干扰植物的代谢,因此还可以用作生长调节剂。

[0325] 植物生长调节剂可对植物产生不同的效应。物质的效果基本上取决于与植物发展阶段相关的施用时间,以及施用至植物或其环境中的活性成分的量 and 施用类型。在每种情况中,生长调节剂应对作物植物具有特定的期望的作用。

[0326] 植物生长调节化合物可用于,例如,抑制植物的营养生长。这种生长的抑制是具有经济价值的,例如,在草的情况中,可因此降低在观赏性花园、公园和体育设施、路边、飞机场或果实作物中割草的频率。重要的还有抑制草本和木本植物在路边和管道附近或高架电缆、或通常在不需植株生长旺盛的地区的生长。

[0327] 重要的还有生长调节剂用于抑制谷物的纵向生长的用途。这降低或完全消除植物在采收之前倒伏的危险。此外,在谷物中,生长调节剂可以增强茎秆(culm),这也可阻止倒伏。采用生长调节剂用于缩短和增强茎秆,使得可以使用更大量的肥料以增加产量,而不会有任何的谷物作物倒伏的危险。

[0328] 在许多作物植物中,抑制营养生长使得可以更密集地种植,因此可基于土壤面积获得更高的产量。以这种方式获得的更小植株的另一优点是作物更容易耕作和采收。

[0329] 抑制营养植物生长还可引起产量提高,因为相比植物的营养部位,营养素和同化物(assimilates)对花和果实的形成更有益。

[0330] 通常,生长调节剂还可用于促进营养生长。当采收营养植物部位时,这是十分有益的。然而,促进营养生长还可促进生殖生长,因为形成了更多的同化物,导致更多或更大的果实。

[0331] 在某些情况中,通过调控植物的新陈代谢可实现产量增加,而在营养生长中没有任何可发觉的变化。此外,生长调节剂可用于改变植物的组成,转而可导致采收产品品质的改善。例如,可增加糖用甜菜、甘蔗、菠萝和柑橘水果中的含糖量,或增加大豆或谷物中的蛋白质含量。还可以,例如,使用生长调节剂抑制采收之前或之后期望的成分的降解,例如糖用甜菜或甘蔗中的糖分。还可积极地影响次级植物成分的产生或消除。一个实例为促进橡胶树中胶乳的流动。

[0332] 在生长调节剂的影响下,可形成单性果实。此外,可影响花的性征。还可产生不育花粉,这在育种和杂种制种中是十分重要的。

[0333] 使用生长调节剂可控制植物分枝。一方面,通过打破顶端优势,可促进侧芽的生长,尤其在培育观赏植物中,这可能是非常期望的,还结合抑制生长。然而,另一方面,还可抑制侧芽的生长。该作用是特别有益的,例如,在烟草培育或番茄培育中。

[0334] 在生长调节剂的影响下,可控制植物上叶子的数量,使得在期望的时间实现植物的脱叶。这种脱叶在棉花的机械采收中发挥重大作用,但还有助于采收其他作物,例如在葡萄栽培中。在植物移植前还可进行植物的脱叶以降低植物的蒸腾作用。

[0335] 生长调节剂还可用于调节果实开裂。一方面,可防止果实过早地开裂。另一方面,为了消除交替,还可促进果实开裂或甚至花败育以实现期望的体量(“疏伐(thinning)”)。

交替应理解为意指一些水果品种的特征,由于内源原因,每年递送非常不同的产量。最后,为了能够进行机械采收或有助于手动采收,可在采收时使用生长调节剂以降低分离果实时所需的力。

[0336] 生长调节剂还可用于在采收之前或之后实现所采收的物质更快地成熟或延迟成熟。这是特别有利的,因为这能够根据市场需求进行优化调节。此外,生长调节剂在某些情况下可改善果实颜色。此外,生长调节剂还可用于在一定的时间段内集中成熟。这为在一次操作中实现完整的机械或手动采收提供了先决条件,例如在烟草、番茄或咖啡的情况中。

[0337] 通过使用生长调节剂,还可影响种子的休眠或植物的发芽,使得植物(如菠萝或苗圃中的观赏植物),例如,在它们通常不易于萌发、发芽或开花的时候萌发、发芽或开花。在存在霜冻风险的地方,可能期望借助生长调节剂而延迟发芽或种子萌发,以避免由晚霜导致的损害。

[0338] 最后,生长调节剂可引发植物对霜冻、干旱或土壤高盐度的抗性。这使得能够在通常不适于该目的的区域培育植物。

[0339] 抗性诱导/植物健康和其他效果

[0340] 本发明的活性化合物还显示对植物的有效的强化作用。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。

[0341] 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,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高程度的抗性。

[0342] 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并被植物良好地耐受。

[0343] 此外,在本发明的上下文中,植物生理学效应包括下列效应:

[0344] 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、水利用率(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。

[0345] 生物胁迫耐受性,包括增加的真菌抗性以及增加的对抗线虫、病毒和细菌的抗性。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

[0346] 增强的植物活力,包括植物健康/植物品质和种子活力、降低的倒伏性、改善的外观、增加的恢复力、改善的绿化效果和改善的光合效率。

[0347] 对植物激素和/或功能酶的影响。

[0348] 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、枝条生长、每穗谷粒的数目、每平方米穗的数目、匍匐枝的数目和/或花朵数目的改善,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/蔬菜大小、发芽抗性和降低的倒伏。

[0349] 增加的产量,指每公顷的总生物量、每公顷的产量、谷粒/果实重量、种子大小和/或百升重量以及指提高的产品品质,包括:

[0350] 与大小分布(谷粒、果实等)相关的改善的加工性、均匀的成熟、谷物含水量、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、消化性、沉降值、降落数值、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奶和/或肉的品质增加、适合烹饪和油炸；

[0351] 还包括与改善的果实/谷物品质、大小分布(谷粒、果实等)相关的改善的可销售性；增加的存储/保质期、硬度/柔软度、味道(香气、质地等)、等级(浆果的大小、形状、数量等)、每束浆果/果实的数目、脆度、鲜度、蜡的盖度、生理病症的频率、颜色等；

[0352] 还包括增加的所需成分，例如蛋白质含量、脂肪酸、油含量、油品质、氨基酸组成、糖含量、酸含量(pH)、糖/酸比(白利糖度(Brix))、多酚类、淀粉含量、营养品质、谷蛋白含量/指数、能量含量、味道等；

[0353] 并且还包含降低的不需要的成分，例如更少的真菌菌素、更少的黄曲霉毒素、土腥素(geosmin)水平、酚类香味、漆酶、多酚氧化酶和过氧化物酶、硝酸盐含量等。

[0354] 可持续农业，包括营养素利用率，特别是氮(N)利用率、磷(P)利用率、水利用率；改善的蒸腾作用、呼吸作用和/或CO₂同化率；更好的结瘤、改善的Ca代谢等。

[0355] 延迟衰老，包括植物生理学的改善，其表现在，例如，更长的灌浆期，导致更高的产量、更长的植物绿叶着色期，因此包括颜色(绿化)，水分含量，干燥度等。因此，在本发明的上下文中，已发现特定的本发明的活性化合物结合物的应用可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的灌浆期，从而带来更高产量。对农民而言的另一优势为采收期更具弹性。

[0356] 其中“沉降值”是蛋白质品质的量度，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——来描述。这被认为是衡量烘焙品质的标准。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品质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组成，并且主要与蛋白质含量、小麦的硬度及平锅和壁炉面包(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的关联可归因于影响体积与Zeleny值二者的蛋白质含量(Czech J.Food Sci.第21卷，第3期：91-96,2000)。

[0357] 另外，本文所提及的“降落数值”是谷物、特别是小麦的烘焙品质的量度。降落数值测试表明可能已经发生芽损坏。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，降落数值测定仪通过测量面粉和水糊对降落柱塞的阻力来分析粘度。柱塞降落发生的时间(以秒为单位)被称为降落数值。降落数值结果被记录为小麦或面粉样品中的酶活力指数，结果以秒为单位的时间进行表示。高降落数值(例如，高于300秒)表示最小的酶活力和优质的小麦或面粉。低降落数值(例如，低于250秒)表示显著的酶活力和存在芽受损的小麦或面粉。

[0358] 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、更多的根毛数目和/或更多的根尖，并可采用合适的方法学和图像分析程序(例如WinRhizo)通过分析根的体系结构对其进行测定。

[0359] 术语“作物水利用率”在技术上是指所消耗的每单位水的农业产品的质量，在经济上是指所消耗的每单位水体积所产生的产品的价值，例如可通过每公顷的产量、植物的生

物量、千谷粒的质量和每平方米的穗数目来衡量。

[0360] 术语“氮利用率”在技术上是指所消耗的每单位氮的农业产品的质量,在经济上指所消耗的每单位氮所产生的产品的价值,反应吸收和利用效率。

[0361] 绿化的改善/改善的颜色和改善的光合效率以及衰老的延迟可通过熟知的技术进行测定,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地指示植物光合性能,健康样品通常达到约0.85的最大Fv/Fm值。如果样品已暴露于某些类型的生物或非生物胁迫因子,该因子已降低了PSII中的能量的光化学淬灭能力,则可观察到低于此数值的值。Fv/Fm表示为变量荧光(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.)

[0362] 绿化的改善/改善的颜色和改善的光合效率以及衰老的延迟还可通过净光合率(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比例)的测定、枝条生长和最终的根和/或株冠生物量的测定,以及分蘖密度和根死亡率的测定来评估。

[0363] 在本发明的上下文中,优选的是改善植物生理学效应,所述效应选自:增强的根生长/更发达的根系、改善的绿化、改善的水利用率(与降低的水消耗相关)、改善的营养素利用率,尤其包括改善的氮(N)利用率、延迟的衰老和提高的产量。

[0364] 在产量的提高中,优选的是沉降值和降落数值的改善以及蛋白质和糖的含量的改善——尤其是选自谷物的植物(优选小麦)。

[0365] 优选地,本发明的杀真菌组合物的新用途涉及a)和b)的组合用途,其中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,b)增强的根生长、改善的绿化、改善的水利用率、延迟的衰老和提高的产量中的至少一种。在b)组中,特别优选根系、水利用率和氮利用率的增强。

[0366] 种子处理

[0367] 本发明还包括处理种子的方法。

[0368] 本发明还涉及通过前文所述方法之一处理的种子。在用于保护种子对抗有害微生物的方法中使用本发明的种子。在这些方法中,使用经至少一种本发明的活性成分处理过的种子。

[0369] 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在贮存期间或播种后以及植物发芽期间或发芽后受侵染引起的。这个阶段特别关键,因为生长植物的根和芽特别敏感,即使微小的损害也可能导致植物死亡。因此,通过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。

[0370] 通过处理植物种子来防治植物致病真菌是长期已知的,并是持续的改进主题。然而,种子处理涉及一系列不能总是以令人满意的方式解决的问题。因此,需要开发用于保护种子和发芽植物的方法,所述方法不需要或至少显著地降低在播种后或植物出苗后作物保护组合物的额外施用。还需要优化所使用的活性成分的量,从而为种子和发芽植物提供尽可能好的保护以使其免受植物致病真菌的侵袭,而不会因所施用的活性成分而损害植物自身。特别地,处理种子的方法还应考虑转基因植物的固有杀真菌特性,以实现用最少量的作

物保护组合物获得对种子和发芽植物的最佳保护。

[0371] 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来保护种子和发芽植物免受植物致病真菌侵袭的方法。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受植物致病真菌侵袭的用途。本发明还涉及经过本发明的组合物处理以抵抗植物致病真菌的种子。

[0372] 对损害出苗后植物的植物致病真菌的防治主要是通过用作物保护组合物处理土壤和植物的地上部位进行。由于考虑到所述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,应努力减少活性成分的用量。

[0373] 本发明的优势之一是:本发明活性成分和组合物的特定内吸特性意味着,用这些活性成分和组合物处理种子不仅保护种子本身还保护萌发后所产生的植物免受植物致病真菌的侵袭。这样,可不必在播种时和在其后不久立即处理所述作物。

[0374] 同样被认为有利的是,本发明的活性成分或组合物还可特别用于转基因种子,在该情况中由该种子长成的植物能够表达抵抗害虫的蛋白。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。令人惊讶的是,在这种情况下可观察到其他协同效应,这可额外提高抵抗害虫侵袭的保护效果。

[0375] 本发明的组合物适于保护在农业、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)。特别重要的是对谷物(例如小麦、大麦、黑麦、黑小麦和燕麦)、玉米和稻的种子的处理。

[0376] 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的种子。合适的异源基因的定义和实例在下文给出。

[0377] 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,在足够稳定以使在处理过程中没有损害发生的条件下处理种子。通常,可在采收和播种之间的任何时间对种子进行处理。所用种子通常已从植物中分离,并已除去肉穗花序、壳、茎、荚、毛或果肉。例如,可以使用已经采收、洗净并干燥至含水量小于15重量%的种子。或者,例如,也可使用干燥后用水处理然后再干燥的种子。

[0378] 当处理种子时,通常需要注意选择施用于种子的本发明的组合物的量和/或其他添加剂的量以使种子的萌发不被损害,或所产生的植物不被损伤。特别是在某些施用率下可具有植物毒性作用的活性成分的情况下,必须牢记这点。

[0379] 本发明的组合物可以直接施用,即,不含其他组分并且不经稀释。通常,优选将所述组合物以合适的制剂形式施用于种子。用于处理种子的合适的制剂和方法是本领域技术人员已知的,并且记载于例如以下文献中: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。

[0380] 根据本发明可使用的活性成分可被转化为常规的拌种制剂,例如溶液剂、乳剂、悬浮剂、粉剂、泡沫剂、浆剂或其他用于种子的包衣组合物,以及ULV制剂。

[0381] 这些制剂可用已知方法通过将活性成分与常规添加剂(例如常规填充剂以及溶剂

或稀释剂、染料、润湿剂、分散剂、乳化剂、消泡剂、防腐剂、二次增稠剂、粘着剂、赤霉素以及水)混合来制备。

[0382] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用的染料为常规用于此目的的所有染料。可使用色素(其微溶于水)或染料(其可溶于水)。实例包括已知的名为罗丹明B、C.I.色素红112和C.I.溶剂红1的染料。

[0383] 可存在于可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常规用于农用化学活性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。

[0384] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用的分散剂和/或乳化剂为常规用于农用化学活性成分制剂中的所有非离子、阴离子和阳离子的分散剂。优选可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,以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。

[0385] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的有用的消泡剂为常规用于农用化学活性成分制剂中的所有泡沫抑制剂。可优选使用硅酮消泡剂和硬脂酸镁。

[0386] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的防腐剂为可在农用化学组合中用于此目的的所有物质。实例包括双氯酚和苄醇半缩甲醛。

[0387] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的二次增稠剂为可在农用化学组合中用于此目的的所有物质。优选的实例包括纤维素衍生物、丙烯酸衍生物、黄原胶、改性粘土以及细分散的二氧化硅。

[0388] 可存在于可根据本发明使用的拌种制剂中的粘着剂为可用于拌种产品的所有常规粘合剂。优选的实例包括聚乙烯吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇和甲基纤维素。

[0389] 可存在于可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)。

[0390] 可根据本发明使用的拌种制剂可以直接使用或先用水稀释后使用,以处理宽范围类型的不同种子,包括转基因植物的种子。在这种情况下,额外的协同效应可在通过表达形成的物质相互作用时发生。

[0391] 对于使用可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,所有常规用于拌种的混合单元都是有用的。具体而言,拌种的步骤是将种子置于混合器中、加入特定所需量的拌种制剂(以其本身或预先以水稀释后)、并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。

[0392] 真菌毒素

[0393] 此外,本发明的处理可以减少所采收的材料以及由此制备的食物和饲料中真菌毒素的含量。特别地,真菌毒素包括但不限于: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(diaceotoxyscirpenol,DAS)、白僵菌素(beauvericin)、恩镰孢菌素(enniatin)、层出镰孢菌素(fusaroproliferin)、镰刀菌醇(fusarenol)、赭曲霉素(ochratoxin)、棒曲霉素(patulin)、麦角生物碱(ergot alkaloid)和黄曲霉毒素(aflatoxin),所述毒素可由例如以下真菌产生:镰孢菌属种(*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*) (玉米赤霉(*Gibberellazeae*))、木贼镰刀菌(*F.equiseti*)、*F.fujikoroi*、香蕉镰刀菌(*F.musarum*)、尖孢镰刀菌(*F.oxysporum*)、再育镰刀菌(*F.proliferatum*)、梨孢键刀菌(*F.poaie*)、*F.pseudograminearum*、接骨木镰刀菌(*F.sambucinum*)、藤草镰刀菌(*F.scirpi*)、半裸镰刀菌(*F.semitectum*)、茄病镰刀菌(*F.solani*)、拟枝孢镰刀菌(*F.sporotrichoides*)、*F.langsethiae*、胶孢镰刀菌(*F.subglutinans*)、三线镰孢菌(*F.tricinctum*)、串珠镰刀菌(*F.verticillioides*)等;以及曲霉属种(*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*);青霉菌属种(*Penicillium spec.*),例如疣孢青霉(*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*)、娄地青霉(*P.roqueforti*);麦角菌属种(*Claviceps spec.*),例如紫麦角菌(*C.purpurea*)、梭形麦角菌(*C.fusiformis*)、雀稗麦角菌(*C.paspali*)、*C.africana*;葡萄穗霉属种(*Stachybotrys spec.*)及其他。

[0394] 材料保护

[0395] 本发明的活性成分或组合物还可用于材料保护,以保护工业材料免受有害微生物(例如真菌和昆虫)的侵袭或破坏。

[0396] 此外,本发明的化合物可单独或与其他活性成分组合用作防污组合物。

[0397] 在本发明的上下文中,工业材料应理解为意指为了用于工业而制备的无生命材料。例如,受本发明的活性成分保护而免于微生物改变或破坏的工业材料可以是粘着剂、胶水、纸张、壁纸和木板/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侵染或破坏的材料。待保护的材料的范围还可包括生产设备和建筑物的部件,例如冷却水回路,冷却和加热系统、通风和空调设备,其可被微生物的增殖损害。在本发明范围内的工业材料优选包括粘着剂、胶料(size)、纸张和卡片、皮革、木材、油漆、冷却润滑剂和传热流体,更优选木材。

[0398] 本发明的活性成分或组合物可预防不利影响,例如腐烂、腐坏、变色、褪色或发霉。

[0399] 在处理木材的情况下,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。术语“木材”意指所有类型的木材品种,以及该木材用于建造的所有类型的加工品,例如实木、高密度木材、胶合板(laminated wood)和夹板(plywood)。根据本发明处理木材的方法主要在于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。

[0400] 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、筛、网、建筑物、系泊和信号系统。

[0401] 本发明的用于防治不想要的真菌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,其具有天然来源并且需要长期保护。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)可以以新鲜采收的状态或通过(预)干燥、润湿、粉碎、研磨、挤压或烘培加工后进行保护。贮存物还包括木材,包括未加工的(例如建筑木材、电线杆和栅栏),或以成品的形式(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不利影响,如腐烂、腐坏、变色、褪色或发霉。

[0402] 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、藻类和粘质有机体(slime organism)。本发明的活性成分优选抵抗真菌,尤其是霉菌、使木材变色和破坏木材的真菌(子囊菌纲(Ascomycetes)、担子菌纲(Basidiomycetes)、半知菌纲(Deuteromycetes)和接合菌纲(Zygomycetes)),以及抵抗粘质有机体和藻类。实例包括以下属的微生物:链格孢属(*Alternaria*),例如细链格孢(*Alternaria tenuis*);曲霉属(*Aspergillus*),例如黑曲霉(*Aspergillus niger*);毛壳菌属(*Chaetomium*),例如球毛壳菌(*Chaetomium globosum*);粉孢革菌属(*Coniophora*),例如粉孢革菌(*Coniophora puetana*);香菇属(*Lentinus*),例如虎皮香菇(*Lentinus tigrinus*);青霉菌属(*Penicillium*),例如灰绿青霉(*Penicillium glaucum*);多孔菌属(*Polyporus*),例如变色多孔菌(*Polyporus versicolor*);短梗霉属(*Aureobasidium*),例如出芽短梗霉(*Aureobasidium pullulans*);核茎点属(*Sclerophoma*),例如*Sclerophoma pityophila*;木霉属(*Trichoderma*),例如绿色木霉(*Trichoderma viride*);长喙壳属种(*Ophiostoma* spp.)、甘薯长喙壳属种(*Ceratocystis* spp.)、腐质霉属种(*Humicola* spp.)、彼得壳属种(*Petriella* spp.)、毛束霉属种(*Trichurus* spp.)、革盖菌属种(*Coriolus* spp.)、粘褶菌属种(*Gloeophyllum* spp.)、侧耳属种(*Pleurotus* spp.)、卧孔菌属种(*Poria* spp.)、干朽菌属种(*Serpula* spp.)、干酪菌属种(*Tyromyces* spp.)、枝孢菌属种(*Cladosporium* spp.)、拟青霉属种(*Paecilomyces* spp.)、毛霉属种(*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*)。

[0403] 抗真菌活性

[0404] 此外,本发明的活性成分也具有非常好的抗真菌活性。它们具有非常宽的抗真菌活性谱,特别是抗皮肤癣菌(dermatophyte)和酵母菌、霉菌和双相性真菌(例如抗念珠菌属(*Candida*)种,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*)种(例如黑霉菌(*A.niger*)和烟曲霉(*A.fumigatus*))、毛癣菌属(*Trichophyton*)种(例如须毛癣菌(*T.mentagrophytes*))、小孢子菌属(*Microsporon*)种(例如犬小芽孢菌(*M.canis*)和奥氏小孢子菌(*M.audouinii*))。所列举的这些真菌绝不构成对所涵盖的真菌谱的限制,而仅为示例性说明。

[0405] 因此,本发明的活性成分可用于医药应用和非医药应用。

[0406] 施用率和时间选择

[0407] 当使用本发明的活性化合物作为杀真菌剂时,施用率可根据施用类型在相对宽的范围内变化。本发明的活性成分的施用率为:

[0408] • 在处理植物部位例如叶的情况下:0.1至10000g/ha,优选10至1000g/ha,更优选10至800g/ha,甚至更优选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);

[0409] • 在处理种子的情况下: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;

[0410] • 在处理土壤的情况下:0.1至10000g/ha,优选1至5000g/ha。

[0411] 这些施用率仅仅是为了示例,而非限制本发明的目的。

[0412] 因此,本发明的包含式(I)化合物的活性成分或组合物可用于在处理后的一个时期内保护植物免受所述病原体的侵袭。在用活性成分处理植物后,提供保护的时间段通常延续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。

[0413] 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组合物处理。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及的化合物或组合物进行植物处理。

[0414] 通过以下实施例对本发明进行说明。然而,本发明不限于这些实施例。

[0415] 制备实施例

[0416] 一般性说明:除非另有说明,所有色谱纯化和分离步骤均在硅胶上进行并且使用0:100的乙酸乙酯/环己烷至100:0的乙酸乙酯/环己烷的溶剂梯度。

[0417] 实施例1:2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-3-氧代-3-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]丙酸乙酯(I-15)的制备

[0418] 步骤1

[0419] 4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-甲酸叔丁酯的制备

[0420] 在室温下,向4-(4-[5-(2-羟基苯基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-甲酸叔丁酯(5.00g)和碳酸钾(3.22g)于N,N-二甲基甲酰胺(75ml)中的溶液中加入3-溴丙-1-炔(3.46g,80%于甲苯中)和碘化钾(1.93g)。将反应混合物在72°C下搅拌12小时。冷却至室温后,向混合物中加入水,用二氯甲烷萃取水相。将合并的有机相用硫酸钠干燥并在减压下浓缩。然后将残余物通过柱色谱法纯化,获得4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-甲酸叔丁酯(4.50g,纯度96%)。

[0421] LogP (pH2.7):4.07^[a]

[0422] 步骤2

[0423] 4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶鎓氯化物的制备

[0424] 在室温下,向4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-甲酸叔丁酯(5.50g)于1,4-二噁烷(120ml)的溶液中加入氯化氢于1,4-二噁烷中的溶液(14.6%,28ml)。将反应混合物在室温下搅拌直至原料完全消耗。然后将反应混合物在减压下浓缩,获得4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-

1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶鎓氯化物(5.10g,纯度93%)。

[0425] LogP (pH2.7) :1.26^[a]

[0426] 步骤3

[0427] 3-氧代-3-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]丙酸乙酯(I-41)的制备

[0428] 在0℃下,向4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶鎓氯化物(1.00g)和三乙胺(0.63g)于二氯甲烷(30ml)的溶液中加入3-氯-3-氧代丙酸乙酯(0.41g)。将反应混合物在室温下搅拌16小时。然后向反应混合物中加入水,分离水相并用二氯甲烷萃取。将合并的有机相用硫酸钠干燥并在减压下浓缩。然后将残余物通过柱色谱法纯化,获得3-氧代-3-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]丙酸乙酯(I-41)(0.57g,纯度92%)。

[0429] LogP (pH2.7) :2.70^[a]

[0430] 步骤4

[0431] 2-溴-3-氧代-3-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]丙酸乙酯(I-30)的制备

[0432] 在室温下,向3-氧代-3-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]丙酸乙酯(I-41,0.49g)于乙酸乙酯(10ml)的溶液中加入1-溴吡咯烷-2,5-二酮(0.18g)。将反应混合物在室温下搅拌直至原料完全消耗。然后向反应混合物中加入水,分离水相并用乙酸乙酯萃取。将合并的有机相用硫酸钠干燥并在减压下浓缩。然后将残余物通过柱色谱法纯化,获得2-溴-3-氧代-3-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]丙酸乙酯(I-30)(0.29g,纯度80%)。

[0433] LogP (pH2.7) :3.18^[a]

[0434] 步骤5

[0435] 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-3-氧代-3-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]丙酸乙酯(I-15)的制备

[0436] 将2-溴-3-氧代-3-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]丙酸乙酯(I-30)(50mg)、3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑(34mg)、碳酸钾(56mg)和碘化钾(3mg)于乙腈(10ml)中的混合物在40℃下搅拌一小时。然后向反应混合物中加入水,分离水相并用二氯甲烷萃取。将合并的有机相用硫酸钠干燥并浓缩,获得无色固体状的2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-3-氧代-3-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基]-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基}-1,3-噻唑-2-基)哌啶-1-基]丙酸乙酯(I-15)(70mg,纯度88%)。

[0437] LogP (pH2.7) :3.69^[a]

[0438] 实施例2:2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-3-{4-[4-(5-{2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基}-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噻唑-2-基]哌啶-1-基}-3-氧代丙酸苄酯(I-60)的制备

[0439] 步骤1

[0440] 3-氯-3-氧代丙酸苄酯的制备

[0441] 在室温下,向3-(苄氧基)-3-氧代丙酸(2.1g)于二氯甲烷(30ml)的溶液中加入乙二酰氯(1.89ml)和N,N-二甲基甲酰胺(0.05ml)。将反应混合物在室温下搅拌2小时。将反应混合物在减压下浓缩。将残余物3-氯-3-氧代丙酸苄酯(2.4g)用于下一步骤而不经任何进一步纯化。

[0442] 步骤2

[0443] 3-(4-氰基哌啶-1-基)-3-氧代丙酸苄酯的制备

[0444] 在0℃下,向3-氯-3-氧代丙酸苄酯(2.4g)和N,N-二乙基乙胺(1.9ml)于二氯甲烷(20ml)的溶液中加入哌啶-4-甲腈(1.0g)于二氯甲烷(10ml)中的溶液。将反应混合物在室温下搅拌16小时。然后向反应混合物中加入水,用二氯甲烷萃取水相。将合并的有机相用硫酸钠干燥并在减压下浓缩。然后将残余物通过柱色谱法纯化,获得3-(4-氰基哌啶-1-基)-3-氧代丙酸苄酯(2.0g)。

[0445] LogP (pH2.7) :1.85^[a]

[0446] 步骤3

[0447] 2-溴-3-(4-氰基哌啶-1-基)-3-氧代丙酸苄酯的制备

[0448] 在室温下,向3-(4-氰基哌啶-1-基)-3-氧代丙酸苄酯(1.9g)于乙酸乙酯(100ml)的溶液中加入1-溴吡咯烷-2,5-二酮(1.18g)。将反应混合物在室温下搅拌16小时。然后向反应混合物中加入水,用乙酸乙酯萃取水相。将合并的有机相用硫酸钠干燥并在减压下浓缩。将残余物通过柱色谱法纯化,获得2-溴-3-(4-氰基哌啶-1-基)-3-氧代丙酸苄酯(1.50g)。

[0449] LogP (pH2.7) :2.24^[a]

[0450] 步骤4

[0451] 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-3-(4-氰基哌啶-1-基)-3-氧代丙酸苄酯(IV-1)的制备

[0452] 在室温下,向2-溴-3-(4-氰基哌啶-1-基)-3-氧代丙酸苄酯(1.30g)和3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑(0.60g)于N,N-二甲基甲酰胺(12ml)的溶液中加入碳酸钾(0.59g)。将反应混合物在室温下搅拌16小时。然后,将反应混合物过滤,向过滤物中加入水,用乙酸乙酯萃取水相。将合并的有机相用硫酸钠干燥并在减压下浓缩。然后将残余物通过柱色谱法纯化,获得2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-3-(4-氰基哌啶-1-基)-3-氧代丙酸苄酯(1.10g)。

[0453] LogP (pH2.7) :2.94^[a]

[0454] 步骤5

[0455] 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-3-(4-硫代氨基甲酰基-哌啶-1-基)-3-氧代丙酸苄酯(II-1)的制备

[0456] 在0℃下,向2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-3-(4-氰基哌啶-1-基)-3-氧代丙酸苄酯(6.70g)于吡啶(67ml)的溶液中加入硫化二铵的溶液(5.77g,21%于水中)。将反应混合物在室温下搅拌16小时。然后,向反应混合物中加入冰冷的水,用乙酸乙酯萃取水相。将合并的有机相用盐水洗涤,用硫酸钠干燥并在减压下浓缩。然后将残余物通过柱色谱法纯化,获得2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-3-(4-硫代氨基甲酰基哌啶-1-基)-3-

氧代丙酸苄酯 (2.90g)。

[0457] LogP (pH2.7) :2.65^[a]

[0458] 步骤6

[0459] 2-[3-(氯乙酰基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基]苯基甲磺酸酯的制备

[0460] 在室温下于氩气下,向2-乙烯基苯基甲磺酸酯 (12.5g) 于乙腈 (300ml) 的溶液中加入碳酸氢钠 (42.4g) 和3-氯-N-羟基-2-氧代丙亚胺酰氯 (9.8g)。将反应混合物在室温下搅拌16小时。将固体抽吸滤出并将滤液在减压下浓缩。将残余物通过柱色谱法纯化,获得2-[3-(氯乙酰基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基]苯基甲磺酸酯 (5.9g)。

[0461] LogP (pH2.7) :2.37^[a]

[0462] 步骤7

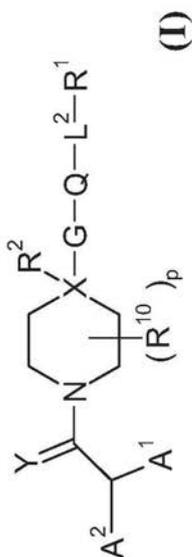
[0463] 2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-3-{4-[4-(5-{2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基}-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噁唑-2-基]哌啶-1-基}-3-氧代丙酸苄酯 (I-60) 的制备

[0464] 将2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-3-(4-硫代氨基甲酰基哌啶-1-基)-3-氧代丙酸苄酯 (2.90g) 和2-[3-(氯乙酰基)-4,5-二氢-1,2-噁唑-5-基]苯基甲磺酸酯 (1.45g) 于乙醇 (100ml) 的溶液在78°C下搅拌16小时。冷却至室温后,将反应混合物在减压下浓缩。然后将残余物通过柱色谱法纯化,获得2-[3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-3-{4-[4-(5-{2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基}-4,5-二氢-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噁唑-2-基]哌啶-1-基}-3-氧代丙酸苄酯 (1.30g)。

[0465] LogP (pH2.7) :3.77^[a]

化合物实施例

[0466]



列于表 1 中的结构元素 G 和 Q 的定义如下:



对于表 1 中所列的所有化合物, A¹是-C(=O)R^{L1}, Y 是氧原子, X 是 C, R²是 H, p = 0 以及 L² = 直连键。

表 1:

实施例	A ²	R ¹	R ^{L1}	Log P ^[a]
I-01	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	异丙氧基	3,53 ^[a]
I-02	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	2-甲氧基乙氧基	3,37 ^[a]
I-03	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-氟-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	乙氧基	3,29 ^[a]
I-04	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	乙氧基	3,57 ^[a]
I-05	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	2-甲氧基乙氧基	3,14 ^[a]
I-06	5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-1-基	2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	乙氧基	3,14 ^[a]
I-07	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	异丙氧基	3,81 ^[a]
I-08	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-氟-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	乙氧基	3,50 ^[a]

[0467]

I-09	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	异丙氧基	3,93 ^[a]
I-10	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	辛-3-基氧基	4,96 ^[a]
I-11	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	乙氧基	3,28 ^[a]
I-12	2-甲基-4-(三氟甲基)-1H-咪唑-1-基	2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	乙氧基	2,99 ^[a]
I-13	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-甲酰基苯基	异丙氧基	3,70 ^[a]
I-14	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-甲酰基苯基	乙氧基	3,40 ^[a]
I-15	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	乙氧基	3,69 ^[a]
I-16	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	乙氧基	3,82 ^[a]
I-17	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-氟-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	异丙氧基	3,49 ^[a]
I-18	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	辛-3-基氧基	5,22 ^[a]
I-19	5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	乙氧基	3,42 ^[a]
I-20	3,5-二甲基-1H-1,2,4-三唑-1-基	2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	乙氧基	2,24 ^[a]
I-21	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-甲酰基苯基	辛-3-基氧基	5,20 ^[a]
I-22	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-氟-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	辛-3-基氧基	4,04 ^[a]
I-23	溴	2-氟-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	异丙氧基	2,97 ^[a]
I-24	溴	2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	2-甲氧基乙氧基	2,85 ^[a]
I-25	溴	2-甲酰基苯基	乙氧基	2,82 ^[a]
I-26	溴	2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	乙氧基	2,98 ^[a]
I-27	溴	2-氟-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	乙氧基	2,72 ^[a]
I-28	溴	2-甲酰基苯基	辛-3-基氧基	4,83 ^[a]
I-29	溴	2-甲酰基苯基	异丙氧基	3,11 ^[a]
I-30	溴	2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	乙氧基	3,18 ^[a]
I-31	溴	2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	乙氧基	3,20 ^[a]
I-32	溴	2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	异丙氧基	3,43 ^[a]
I-33	溴	2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	乙氧基	2,72 ^[a]
I-34	溴	2-氟-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	乙氧基	2,92 ^[a]
I-35	溴	2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	辛-3-基氧基	4,89 ^[a]
I-36	溴	2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	2-甲氧基乙氧基	2,53 ^[a]

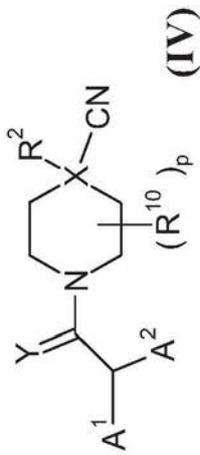
[0468]

I-37	溴		2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	异丙氧基	2,99 ^[a]
I-38	溴		2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	异丙氧基	3,30 ^[a]
I-39	溴		2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	辛-3-基氧基	4,55 ^[a]
I-40	H		2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	辛-3-基氧基	4,42 ^[a]
I-41	H		2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	乙氧基	2,70 ^[a]
I-42	H		2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	乙氧基	2,58 ^[a]
I-43	H		2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	2-甲氧基乙氧基	2,43 ^[a]
I-44	H		2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	异丙氧基	2,85 ^[a]
I-45	H		2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	辛-3-基氧基	4,07 ^[a]
I-46	H		2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	2-甲氧基乙氧基	2,11 ^[a]
I-47	H		2-氟-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	异丙氧基	2,53 ^[a]
I-48	H		2-氟-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	辛-3-基氧基	4,03 ^[a]
I-49	H		2-氟-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	乙氧基	2,53 ^[a]
I-50	H		2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	乙氧基	2,30 ^[a]
I-51	H		2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	乙氧基	2,81 ^[a]
I-52	H		2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	异丙氧基	2,94 ^[a]
I-53	H		2-甲酰基苯基	乙氧基	2,34 ^[a]
I-54	H		2-氟-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	乙氧基	2,29 ^[a]
I-55	H		2-甲酰基苯基	辛-3-基氧基	4,27 ^[a]
I-56	H		2-甲酰基苯基	异丙氧基	2,57 ^[a]
I-57	H		2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	辛-3-基氧基	4,56 ^[a]
I-58	H		2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	异丙氧基	2,56 ^[a]
I-59	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基		2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	辛氧基	4,28 ^[a]
I-60	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基		2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	辛氧基	3,77 ^[a]
I-61	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基		2-氟-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	辛氧基	3,98 ^[a]
I-62	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基		2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	辛氧基	4,16 ^[a]
I-63	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基		2-氟-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	叔丁氧基	4,31 ^[a]
I-64	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基		2-氟-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	叔丁氧基	4,00 ^[a]

[0469]

I-65	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	叔丁氧基	4,16 ^[a]
I-66	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	叔丁氧基	3,74 ^[a]
I-67	溴	2-氯-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	苄氧基	3,54 ^[a]
I-68	溴	2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	苄氧基	3,31 ^[a]
I-69	溴	2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	苄氧基	3,85 ^[a]
I-70	溴	2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	苄氧基	3,72 ^[a]
I-71	溴	2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	叔丁氧基	3,84 ^[a]
I-72	溴	2-氯-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	叔丁氧基	3,50 ^[a]
I-73	溴	2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	叔丁氧基	3,68 ^[a]
I-74	溴	2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	叔丁氧基	3,24 ^[a]
I-75	H	2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	苄氧基	2,89 ^[a]
I-76	H	2-氯-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	苄氧基	3,12 ^[a]
I-77	H	2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	苄氧基	3,30 ^[a]
I-78	H	2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	苄氧基	3,45 ^[a]
I-79	H	2-氯-6-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	叔丁氧基	3,04 ^[a]
I-80	H	2-氯-6-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	叔丁氧基	3,36 ^[a]
I-81	H	2-[(甲基磺酰基)氧基]苯基	叔丁氧基	2,80 ^[a]
I-82	H	2-(丙-2-炔-1-基氧基)苯基	叔丁氧基	3,22 ^[a]

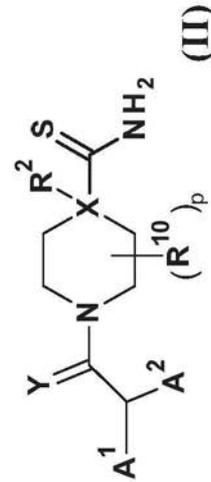
[0470]



对于表 2 中所列的所有化合物, A^1 是 $-C(=O)R^{L1}$, Y 是氧原子, X 是 C , R^2 是 H 以及 p 代表 0。

表 2

实施例	A^2	R^{L1}	$\text{Log } P^{[a]}$
IV-01	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	乙氧基	2,28 ^[a]
IV-02	H	苄氧基	1,85 ^[a]
IV-03	溴	苄氧基	2,24 ^[a]
IV-04	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	苄氧基	2,94 ^[a]
IV-05	H	叔丁氧基	
IV-06	溴	叔丁氧基	2,02 ^[a]
IV-07	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	叔丁氧基	2,81 ^[a]



对于表 3 中所列的所有化合物, A^1 是 $-C(=O)R^{L1}$, Y 是氧原子, X 是 C , R^2 是 H 以及 p 代表 0。

[0471]

表 3

实施例	A ²	R ^{L1}	Log P ^[a]
II-01	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	苄氧基	2,65 ^[a]
II-02	3,5-双(二氟甲基)-1H-吡唑-1-基	叔丁氧基	2,54 ^[a]

根据 EEC 指导原则 79/831 附录 V.A8 通过 HPLC (高效液相色谱法) 在反相柱 (C18) 上测定 logP 值, 测定方法如下:

^[a]在 pH 2.7 的酸性范围内进行 LC-MS 测定, 以 0.1% 甲酸水溶液和乙腈 (含 0.1% 甲酸) 为洗脱液; 线性梯度为 10% 的乙腈至 95% 的乙腈。

用具有已知 logP 值 (基于在两个连续的烷酮之间的线性内插法的保留时间测定的 logP 值) 的未支化烷-2-酮 (含有 3 至 16 个碳原子) 进行校准。

使用 200 nm 至 400 nm 的 UV 光谱在色谱信号最大值处测定 λ 最大值。

所选实施例的 NMR 数据

NMR 峰列表方法

所选实施例的 ¹H NMR 数据以 ¹H-NMR 峰列表的形式记录。就每个信号峰而言, 首先列出了以 ppm 计的 δ 值并随后列出了位于圆括号中的信号强度。不同信号峰的 δ 值-信号强度数值对通过分号间隔列出。

因此, 一个实施例的峰以下列形式列出:

δ_1 (强度 i); δ_2 (强度 2);; δ_i (强度 i);; δ_n (强度 n)

[0472]

实施例 I-01: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ = 8.055 (4.0); 8.022 (4.8); 7.503 (1.1); 7.486 (1.9); 7.466 (1.5); 7.462 (1.4); 7.451 (6.0); 7.447 (4.8); 7.436 (0.7); 7.432 (0.8); 7.425 (1.0);
 7.419 (1.7); 7.413 (1.0); 7.400 (2.0); 7.385 (0.7); 7.379 (0.5); 7.370 (0.6); 7.266 (1.1); 7.237 (1.1); 7.218 (0.8); 7.212 (0.6); 7.205 (0.5);
 7.134 (0.8); 7.104 (0.6); 7.082 (1.8); 7.076 (1.3); 7.069 (1.2); 7.054 (2.9); 6.947 (0.8); 6.941 (0.6); 6.934 (0.5); 6.794 (2.3); 6.729 (3.2);
 6.009 (0.7); 5.999 (0.9); 5.990 (0.8); 5.980 (1.5); 5.971 (1.0); 5.962 (0.7); 5.952 (0.9); 5.044 (0.4); 5.035 (0.8); 5.028 (1.1); 5.019 (1.2);
 5.013 (1.5); 5.004 (0.9); 4.997 (1.1); 4.988 (0.4); 4.981 (0.4); 4.458 (0.6); 4.426 (0.6); 4.398 (0.4); 4.364 (0.4); 4.056 (0.3); 4.038 (1.0);
 4.020 (1.0); 4.003 (0.4); 3.994 (0.5); 3.968 (1.2); 3.950 (0.7); 3.940 (1.0); 3.925 (1.4); 3.897 (0.9); 3.795 (0.4); 3.764 (0.4); 3.728 (0.5);
 3.695 (0.6); 3.554 (12.5); 3.548 (16.0); 3.357 (1.1); 3.349 (0.8); 3.337 (2.5); 3.325 (32.8); 3.294 (1.8); 3.274 (0.9); 3.258 (0.4); 3.228 (0.7);
 3.198 (0.4); 2.947 (0.5); 2.920 (0.9); 2.891 (2.3); 2.856 (0.6); 2.732 (1.1); 2.525 (1.1); 2.511 (20.2); 2.507 (40.2); 2.502 (52.6); 2.498 (38.0);
 2.493 (18.4); 2.329 (0.3); 2.118 (0.4); 2.082 (0.8); 2.046 (0.5); 1.989 (4.4); 1.945 (0.5); 1.838 (0.7); 1.825 (0.5); 1.808 (0.6); 1.615 (0.3);
 1.504 (0.5); 1.495 (0.5); 1.473 (0.5); 1.464 (0.4); 1.397 (0.9); 1.250 (0.5); 1.222 (13.1); 1.207 (12.8); 1.193 (1.6); 1.175 (2.4); 1.157 (1.2);
 0.902 (0.4); 0.894 (0.5); 0.871 (0.5); 0.863 (0.4); 0.008 (0.4); 0.000 (13.2); -0.009 (0.5)

实施例 I-02: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ = 7.972 (3.8); 7.944 (4.9); 7.432 (0.7); 7.411 (1.7); 7.401 (1.0); 7.393 (1.9); 7.372 (1.0); 7.269 (1.2); 7.235 (1.1); 7.217 (0.9); 7.213 (1.0);
 7.136 (0.8); 7.103 (0.6); 7.082 (2.0); 7.077 (2.2); 7.065 (2.4); 7.056 (2.0); 7.009 (2.8); 6.987 (2.5); 6.947 (1.0); 6.942 (1.1); 6.905 (3.4);
 6.884 (1.9); 6.856 (3.5); 6.071 (0.6); 6.060 (0.8); 6.049 (0.8); 6.038 (1.2); 6.029 (0.9); 6.019 (0.7); 6.006 (0.8); 4.843 (5.5); 4.839 (5.6);
 4.453 (0.6); 4.419 (0.7); 4.370 (0.5); 4.355 (0.5); 4.345 (0.6); 4.332 (0.6); 4.325 (0.8); 4.314 (1.5); 4.302 (1.7); 4.292 (1.0); 4.280 (1.0);
 4.272 (1.1); 4.262 (1.2); 4.250 (0.9); 4.242 (0.5); 4.234 (0.5); 4.229 (0.5); 4.220 (0.4); 3.828 (0.4); 3.804 (0.7); 3.794 (0.5); 3.777 (1.0);
 3.761 (1.0); 3.746 (1.2); 3.735 (1.4); 3.707 (0.8); 3.534 (5.0); 3.521 (5.2); 3.496 (1.6); 3.474 (1.2); 3.454 (1.1); 3.431 (0.6); 3.368 (0.6);
 3.360 (0.5); 3.337 (1.2); 3.321 (38.5); 3.279 (0.5); 3.238 (16.0); 3.219 (0.5); 3.187 (11.6); 3.009 (0.3); 2.982 (0.5); 2.940 (0.6); 2.908 (1.1);
 2.874 (0.6); 2.675 (0.4); 2.670 (0.5); 2.666 (0.4); 2.541 (30.1); 2.524 (1.1); 2.506 (61.8); 2.501 (79.0); 2.497 (56.9); 2.493 (27.6); 2.333

[0473]

(0.4); 2.328 (0.5); 2.324 (0.4); 2.145 (0.4); 2.108 (0.6); 2.074 (6.3); 2.006 (0.3); 1.974 (0.5); 1.873 (0.8); 1.845 (0.8); 1.643 (0.4); 1.618 (0.3); 1.514 (0.4); 1.485 (0.4); 0.945 (0.4); 0.915 (0.4); 0.146 (0.3); 0.008 (3.4); 0.000 (80.8); -0.009 (3.6); -0.150 (0.4)

实施例 I-03: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.040 (3.4); 8.011 (4.5); 7.953 (2.3); 7.590 (0.7); 7.569 (1.5); 7.553 (1.6); 7.532 (0.9); 7.406 (0.7); 7.380 (0.5); 7.345 (1.1); 7.329 (3.5); 7.308 (2.4); 7.273 (1.2); 7.247 (1.1); 7.220 (0.7); 7.213 (0.6); 7.141 (0.8); 7.114 (0.6); 7.085 (1.6); 7.077 (1.4); 7.073 (1.4); 7.061 (2.7); 6.950 (0.8); 6.942 (0.6); 6.939 (0.6); 6.839 (2.2); 6.793 (3.0); 6.049 (0.6); 6.039 (0.7); 6.026 (0.8); 6.017 (1.2); 6.009 (0.9); 5.996 (0.6); 5.986 (0.7); 4.459 (0.6); 4.426 (0.6); 4.404 (0.5); 4.372 (0.5); 4.259 (0.4); 4.250 (0.9); 4.242 (1.1); 4.232 (2.9); 4.228 (2.1); 4.225 (2.1); 4.214 (3.1); 4.197 (1.3); 4.038 (0.8); 4.020 (0.8); 3.898 (0.4); 3.870 (0.8); 3.854 (0.6); 3.842 (0.6); 3.827 (1.0); 3.800 (0.9); 3.769 (0.5); 3.750 (0.6); 3.715 (0.7); 3.548 (10.9); 3.541 (13.4); 3.506 (1.3); 3.484 (1.2); 3.463 (1.0); 3.440 (0.6); 3.379 (0.4); 3.369 (0.6); 3.360 (0.6); 3.350 (0.9); 3.339 (1.2); 3.324 (20.9); 3.274 (0.4); 3.244 (0.7); 3.214 (0.4); 2.967 (0.6); 2.936 (0.9); 2.901 (1.4); 2.891 (16.0); 2.872 (0.7); 2.731 (13.6); 2.506 (35.4); 2.502 (45.1); 2.498 (33.5); 2.138 (0.4); 2.104 (0.8); 2.065 (0.6); 1.989 (3.4); 1.969 (0.5); 1.869 (0.8); 1.841 (0.8); 1.633 (0.4); 1.603 (0.3); 1.510 (0.5); 1.501 (0.3); 1.490 (0.3); 1.480 (0.5); 1.397 (0.5); 1.250 (0.3); 1.224 (3.9); 1.220 (3.3); 1.206 (7.9); 1.202 (6.4); 1.188 (4.0); 1.184 (3.1); 1.175 (1.9); 1.157 (0.9); 0.934 (0.5); 0.903 (0.5); 0.000 (18.3); -0.008 (0.9)

实施例 I-04: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 7.973 (4.1); 7.953 (2.2); 7.945 (5.5); 7.432 (0.7); 7.411 (1.7); 7.394 (1.7); 7.380 (0.7); 7.374 (0.9); 7.272 (1.2); 7.247 (1.1); 7.221 (0.8); 7.215 (0.9); 7.141 (0.8); 7.115 (0.6); 7.086 (1.9); 7.080 (2.1); 7.064 (2.4); 7.009 (2.6); 6.988 (2.4); 6.951 (0.9); 6.945 (1.0); 6.907 (1.1); 6.885 (1.7); 6.860 (1.0); 6.839 (2.3); 6.794 (3.0); 6.071 (0.6); 6.059 (0.8); 6.049 (0.7); 6.038 (1.1); 6.029 (0.8); 6.018 (0.6); 6.006 (0.7); 4.845 (5.2); 4.840 (5.3); 4.459 (0.5); 4.425 (0.6); 4.405 (0.4); 4.372 (0.4); 4.259 (0.4); 4.250 (0.9); 4.246 (0.7); 4.242 (1.0); 4.232 (2.9); 4.229 (1.9); 4.224 (2.0); 4.215 (3.2); 4.211 (1.9); 4.207 (1.8); 4.197 (1.3); 4.189 (0.6); 4.056 (0.4); 4.038 (1.2); 4.020 (1.2); 4.002 (0.4); 3.806 (0.7); 3.777 (1.1); 3.762 (1.0); 3.749 (1.0); 3.735 (1.1); 3.708 (0.9); 3.540 (0.9); 3.535 (1.9); 3.529 (1.8); 3.522 (2.3); 3.496 (1.3); 3.473 (1.0); 3.454 (1.0); 3.430 (0.6); 3.375 (0.4); 3.366 (0.5); 3.356 (0.6); 3.347 (1.0); 3.337 (1.2); 3.323 (27.1); 3.308 (0.6); 3.276 (0.4); 3.245 (0.7); 3.215 (0.4); 2.968 (0.5); 2.939 (0.8); 2.905 (1.1); 2.890 (16.0); 2.873 (0.6); 2.731 (12.9); 2.671 (0.4); 2.524 (1.2); 2.511 (22.7);

[0474]

2.506 (44.7); 2.502 (57.7); 2.497 (40.9); 2.493 (19.2); 2.328 (0.4); 2.139 (0.4); 2.103 (0.7); 2.066 (0.5); 1.989 (5.3); 1.971 (0.4); 1.871 (0.6); 1.839 (0.7); 1.511 (0.4); 1.481 (0.4); 1.397 (1.1); 1.224 (4.3); 1.220 (3.4); 1.206 (9.0); 1.202 (6.8); 1.192 (2.1); 1.188 (4.3); 1.185 (3.3); 1.175 (2.8); 1.157 (1.3); 0.940 (0.4); 0.909 (0.4); 0.008 (2.5); 0.000 (61.9); -0.009 (2.0)

实施例 I-05: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.056 (3.6); 8.024 (4.1); 7.508 (1.3); 7.489 (1.9); 7.466 (1.2); 7.462 (1.2); 7.451 (5.2); 7.447 (4.1); 7.436 (0.6); 7.432 (0.7); 7.424 (0.9); 7.419 (1.4); 7.413 (0.8); 7.400 (1.6); 7.385 (0.6); 7.379 (0.4); 7.365 (0.5); 7.266 (1.0); 7.233 (0.9); 7.216 (0.7); 7.205 (0.4); 7.134 (0.7); 7.100 (0.5); 7.081 (1.6); 7.077 (1.2); 7.069 (1.6); 7.062 (2.2); 6.946 (0.7); 6.942 (0.6); 6.934 (0.5); 6.902 (2.0); 6.852 (2.6); 6.009 (0.6); 5.999 (0.8); 5.989 (0.7); 5.980 (1.3); 5.971 (0.9); 5.961 (0.6); 5.951 (0.8); 4.450 (0.4); 4.415 (0.5); 4.398 (0.4); 4.363 (0.4); 4.354 (0.5); 4.344 (0.5); 4.340 (0.5); 4.330 (0.6); 4.324 (0.7); 4.310 (1.3); 4.300 (1.4); 4.287 (0.8); 4.277 (0.8); 4.270 (0.9); 4.260 (1.0); 4.258 (1.0); 4.247 (0.8); 4.240 (0.4); 4.231 (0.4); 4.227 (0.4); 3.994 (0.5); 3.968 (1.0); 3.951 (0.7); 3.941 (0.8); 3.925 (1.2); 3.897 (0.8); 3.782 (0.4); 3.745 (0.6); 3.712 (0.5); 3.554 (11.2); 3.547 (14.4); 3.531 (2.8); 3.518 (2.4); 3.509 (0.9); 3.506 (0.8); 3.358 (1.1); 3.338 (2.2); 3.324 (33.8); 3.295 (1.5); 3.275 (1.0); 3.237 (16.0); 3.209 (0.4); 3.204 (0.4); 3.183 (11.3); 2.967 (0.4); 2.933 (0.5); 2.927 (0.5); 2.917 (0.3); 2.895 (0.8); 2.869 (0.4); 2.862 (0.4); 2.671 (0.4); 2.541 (1.0); 2.524 (1.1); 2.520 (1.8); 2.511 (22.2); 2.506 (45.2); 2.502 (59.7); 2.497 (43.0); 2.493 (20.5); 2.329 (0.4); 2.086 (0.5); 2.075 (4.9); 2.051 (0.5); 2.049 (0.5); 1.954 (0.4); 1.857 (0.7); 1.826 (0.6); 1.507 (0.4); 1.498 (0.4); 1.476 (0.4); 1.467 (0.4); 0.921 (0.4); 0.913 (0.4); 0.891 (0.4); 0.882 (0.3); 0.008 (0.5); 0.000 (15.3); -0.009 (0.5)

实施例 I-06: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.057 (4.7); 8.043 (4.8); 7.954 (0.9); 7.515 (1.0); 7.500 (1.7); 7.486 (1.7); 7.467 (1.6); 7.464 (1.5); 7.452 (6.4); 7.435 (0.9); 7.426 (1.2); 7.420 (1.8); 7.414 (1.0); 7.404 (1.5); 7.402 (1.5); 7.386 (0.8); 7.380 (0.4); 7.014 (7.3); 6.011 (0.8); 6.004 (0.9); 5.992 (1.0); 5.984 (1.8); 5.976 (1.1); 5.964 (0.9); 5.957 (0.9); 5.756 (0.6); 4.453 (0.6); 4.422 (1.1); 4.391 (0.6); 4.315 (0.5); 4.307 (1.0); 4.302 (0.8); 4.296 (1.0); 4.289 (3.1); 4.285 (2.0); 4.278 (2.0); 4.271 (3.3); 4.267 (2.0); 4.260 (1.7); 4.253 (1.3); 4.242 (0.6); 4.233 (0.3); 4.038 (0.6); 4.021 (0.6); 4.003 (0.4); 3.997 (0.7); 3.974 (1.0); 3.970 (1.0); 3.954 (0.9); 3.946 (1.0); 3.930 (1.2); 3.903 (0.8); 3.823 (0.5); 3.786 (0.9); 3.750 (0.6); 3.555 (14.5); 3.548 (16.0); 3.400 (0.4); 3.391 (0.7); 3.381 (0.5); 3.371 (1.0); 3.362 (2.1); 3.353 (1.0); 3.342 (2.1); 3.325 (38.5); 3.298 (1.4);

[0475]

3.279 (1.1); 3.250 (0.8); 3.220 (0.4); 3.092 (0.4); 3.062 (0.7); 3.035 (0.4); 2.957 (0.6); 2.948 (0.5); 2.925 (1.1); 2.891 (7.6); 2.732 (5.7); 2.672 (0.3); 2.525 (1.1); 2.512 (20.2); 2.507 (38.5); 2.498 (36.3); 2.494 (17.5); 2.457 (12.4); 2.445 (11.0); 2.330 (0.3); 2.142 (0.5); 2.111 (0.8); 2.096 (0.8); 2.034 (0.4); 2.005 (0.5); 1.989 (3.0); 1.971 (0.5); 1.941 (0.5); 1.839 (0.4); 1.830 (0.4); 1.808 (0.4); 1.800 (0.3); 1.619 (0.4); 1.611 (0.4); 1.589 (0.4); 1.580 (0.4); 1.518 (0.5); 1.510 (0.3); 1.496 (0.3); 1.488 (0.5); 1.337 (1.3); 1.253 (4.8); 1.250 (5.5); 1.236 (9.5); 1.232 (8.2); 1.218 (4.4); 1.214 (3.8); 1.193 (0.9); 1.175 (1.5); 1.158 (0.7); 1.106 (0.5); 1.075 (0.5); 0.000 (0.4)

实施例 I-07: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 7.973 (3.2); 7.944 (4.4); 7.432 (0.7); 7.412 (1.6); 7.403 (1.0); 7.394 (1.8); 7.374 (1.3); 7.271 (1.2); 7.241 (1.0); 7.219 (0.8); 7.214 (0.9); 7.138 (0.8); 7.108 (0.6); 7.084 (1.7); 7.078 (2.0); 7.059 (2.6); 7.009 (2.6); 6.988 (2.4); 6.949 (0.9); 6.943 (1.0); 6.907 (1.2); 6.884 (1.8); 6.860 (1.0); 6.797 (2.2); 6.734 (2.9); 6.071 (0.6); 6.059 (0.7); 6.049 (0.7); 6.038 (1.1); 6.029 (0.9); 6.019 (0.6); 6.006 (0.7); 5.045 (0.4); 5.037 (0.8); 5.030 (1.0); 5.022 (1.1); 5.014 (1.3); 5.006 (0.8); 4.998 (1.0); 4.991 (0.4); 4.983 (0.4); 4.844 (5.1); 4.840 (5.3); 4.463 (0.6); 4.429 (0.6); 4.401 (0.4); 4.368 (0.4); 4.038 (0.5); 4.020 (0.5); 3.803 (0.7); 3.775 (1.1); 3.762 (0.9); 3.747 (1.0); 3.735 (1.4); 3.705 (1.2); 3.539 (0.9); 3.533 (1.8); 3.527 (1.9); 3.522 (2.5); 3.496 (1.3); 3.473 (1.0); 3.453 (0.9); 3.430 (0.6); 3.369 (0.5); 3.332 (24.4); 3.303 (0.5); 3.268 (0.4); 3.237 (0.8); 3.206 (0.4); 2.957 (0.5); 2.931 (0.9); 2.901 (1.3); 2.891 (2.6); 2.871 (0.7); 2.732 (1.9); 2.671 (0.4); 2.506 (53.2); 2.502 (66.2); 2.497 (48.3); 2.329 (0.4); 2.137 (0.4); 2.098 (0.8); 2.063 (0.6); 1.989 (2.6); 1.964 (0.5); 1.868 (0.8); 1.836 (0.8); 1.636 (0.4); 1.607 (0.4); 1.512 (0.5); 1.482 (0.4); 1.398 (2.6); 1.224 (16.0); 1.209 (15.8); 1.193 (1.0); 1.175 (1.3); 1.157 (0.7); 0.925 (0.5); 0.894 (0.5); 0.008 (1.6); 0.000 (34.8)

实施例 I-08: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.050 (5.5); 8.021 (7.2); 7.581 (1.3); 7.577 (1.2); 7.564 (2.9); 7.561 (4.6); 7.557 (5.0); 7.554 (3.3); 7.534 (4.0); 7.517 (1.6); 7.514 (1.9); 7.489 (2.3); 7.485 (4.1); 7.481 (2.5); 7.469 (1.3); 7.465 (2.2); 7.461 (1.4); 7.404 (1.0); 7.378 (0.7); 7.271 (1.6); 7.245 (1.4); 7.219 (1.0); 7.210 (0.9); 7.139 (1.1); 7.113 (0.9); 7.084 (2.3); 7.074 (2.0); 7.072 (2.1); 7.061 (3.3); 6.949 (1.1); 6.939 (0.9); 6.836 (2.9); 6.791 (4.1); 6.190 (0.9); 6.178 (1.2); 6.162 (1.4); 6.160 (1.3); 6.151 (1.8); 6.132 (1.0); 6.121 (1.2); 4.457 (0.7); 4.424 (0.8); 4.403 (0.6); 4.369 (0.6); 4.258 (0.6); 4.249 (1.3); 4.241 (1.5); 4.231 (4.2); 4.227 (2.7); 4.224 (3.0); 4.213 (4.6); 4.209 (2.7); 4.206 (2.7); 4.196 (1.8); 4.179 (0.4);

[0476]

4.056 (0.4); 4.038 (1.2); 4.020 (1.2); 4.002 (0.4); 3.857 (0.6); 3.826 (1.0); 3.813 (1.2); 3.800 (1.4); 3.786 (1.5); 3.756 (1.5); 3.714 (0.8); 3.586 (1.1); 3.564 (1.4); 3.559 (1.2); 3.542 (1.4); 3.529 (14.5); 3.519 (16.0); 3.494 (1.0); 3.379 (0.6); 3.368 (0.7); 3.360 (0.8); 3.350 (1.3); 3.340 (1.7); 3.323 (66.4); 3.273 (0.6); 3.242 (0.9); 3.213 (0.5); 2.993 (0.4); 2.964 (0.7); 2.935 (1.1); 2.903 (1.4); 2.891 (2.8); 2.877 (0.7); 2.870 (0.8); 2.731 (1.7); 2.675 (0.5); 2.671 (0.7); 2.666 (0.5); 2.565 (1.0); 2.524 (2.1); 2.511 (38.2); 2.506 (76.0); 2.502 (99.2); 2.497 (71.1); 2.493 (33.5); 2.333 (0.5); 2.329 (0.7); 2.324 (0.5); 2.137 (0.5); 2.101 (1.0); 2.066 (0.7); 1.989 (5.5); 1.967 (0.6); 1.867 (0.9); 1.840 (1.0); 1.631 (0.4); 1.601 (0.5); 1.508 (0.6); 1.499 (0.4); 1.486 (0.4); 1.477 (0.6); 1.468 (0.4); 1.398 (1.4); 1.336 (0.5); 1.250 (0.7); 1.223 (5.7); 1.219 (4.4); 1.205 (11.7); 1.201 (8.7); 1.193 (2.6); 1.188 (5.6); 1.183 (4.1); 1.175 (3.1); 1.157 (1.4); 0.929 (0.6); 0.899 (0.6); 0.890 (0.4); 0.008 (2.4); 0.000 (66.2); -0.009 (2.1)

实施例 I-09: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.012 (3.6); 7.979 (3.8); 7.398 (0.7); 7.368 (0.6); 7.341 (1.1); 7.320 (3.1); 7.313 (1.9); 7.300 (2.7); 7.294 (1.9); 7.264 (1.3); 7.235 (1.1); 7.216 (0.8); 7.205 (0.6); 7.148 (3.0); 7.128 (2.6); 7.102 (0.7); 7.081 (1.8); 7.076 (1.4); 7.069 (1.3); 7.051 (3.4); 7.014 (1.3); 6.996 (2.3); 6.977 (1.1); 6.946 (0.9); 6.941 (0.7); 6.934 (0.5); 6.794 (2.4); 6.726 (3.1); 5.884 (0.7); 5.875 (0.9); 5.867 (0.8); 5.857 (1.6); 5.847 (1.0); 5.839 (0.8); 5.830 (0.9); 5.051 (0.3); 5.042 (0.5); 5.036 (0.9); 5.027 (1.2); 5.020 (1.2); 5.011 (1.5); 5.004 (0.9); 4.996 (1.2); 4.989 (0.4); 4.980 (0.4); 4.878 (4.0); 4.873 (7.5); 4.868 (5.0); 4.454 (0.6); 4.422 (0.6); 4.394 (0.5); 4.360 (0.5); 4.038 (0.7); 4.020 (0.7); 3.893 (0.6); 3.866 (1.2); 3.850 (0.8); 3.839 (1.0); 3.824 (1.5); 3.796 (1.3); 3.763 (0.5); 3.727 (0.6); 3.691 (0.6); 3.586 (0.9); 3.580 (2.0); 3.576 (1.9); 3.571 (2.4); 3.566 (1.1); 3.323 (23.2); 3.301 (0.8); 3.282 (0.5); 3.260 (1.1); 3.242 (1.7); 3.223 (1.8); 3.199 (1.5); 3.180 (1.0); 2.945 (0.6); 2.915 (0.9); 2.890 (1.6); 2.883 (1.3); 2.851 (0.7); 2.731 (0.6); 2.675 (0.3); 2.671 (0.4); 2.666 (0.3); 2.511 (27.2); 2.506 (52.9); 2.502 (68.6); 2.497 (50.8); 2.333 (0.3); 2.329 (0.5); 2.324 (0.3); 2.111 (0.4); 2.074 (0.9); 2.041 (0.6); 1.989 (2.9); 1.938 (0.5); 1.833 (0.7); 1.806 (0.7); 1.606 (0.4); 1.581 (0.3); 1.492 (0.5); 1.462 (0.5); 1.397 (8.4); 1.336 (0.4); 1.249 (0.5); 1.242 (0.6); 1.222 (16.0); 1.206 (15.7); 1.193 (1.3); 1.175 (1.7); 1.157 (0.8); 0.901 (0.5); 0.893 (0.5); 0.872 (0.5); 0.008 (1.6); 0.000 (39.5); -0.008 (1.7)

实施例 I-10: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.057 (2.4); 8.020 (3.9); 7.506 (1.5); 7.487 (2.4); 7.466 (1.3); 7.462 (1.5); 7.450 (5.2); 7.447 (5.1); 7.432 (0.9); 7.419 (1.6); 7.414 (1.6);

[0477]

7.401 (1.5); 7.385 (0.6); 7.379 (0.5); 7.364 (0.4); 7.280 (0.9); 7.238 (0.5); 7.230 (0.5); 7.209 (0.6); 7.202 (0.4); 7.194 (0.4); 7.148 (0.7); 7.073 (1.3); 7.055 (3.7); 6.938 (0.6); 6.929 (0.4); 6.924 (0.4); 6.870 (0.8); 6.863 (0.8); 6.757 (2.3); 6.011 (0.6); 5.998 (0.9); 5.993 (0.8); 5.979 (1.1); 5.970 (1.0); 5.964 (0.7); 5.951 (0.8); 4.819 (1.0); 4.811 (0.9); 4.806 (0.9); 4.463 (0.5); 4.429 (0.5); 4.403 (0.4); 4.371 (0.4); 4.056 (0.4); 4.038 (1.4); 4.020 (1.4); 4.002 (0.5); 3.991 (0.5); 3.966 (1.0); 3.948 (0.6); 3.939 (0.9); 3.923 (1.2); 3.895 (0.8); 3.720 (0.5); 3.686 (0.5); 3.550 (13.4); 3.546 (16.0); 3.515 (0.4); 3.512 (0.6); 3.368 (0.3); 3.350 (1.2); 3.331 (1.8); 3.322 (38.7); 3.291 (1.3); 3.273 (0.9); 3.230 (0.6); 3.199 (0.3); 2.985 (0.3); 2.957 (0.4); 2.917 (0.6); 2.891 (3.0); 2.854 (0.6); 2.731 (1.7); 2.676 (0.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.4); 2.524 (1.5); 2.511 (30.6); 2.507 (61.5); 2.502 (82.0); 2.497 (60.7); 2.493 (29.8); 2.333 (0.4); 2.329 (0.6); 2.324 (0.4); 2.122 (0.4); 2.080 (0.6); 2.044 (0.5); 1.989 (6.1); 1.944 (0.4); 1.825 (0.6); 1.803 (0.5); 1.598 (0.7); 1.575 (1.1); 1.563 (1.3); 1.557 (1.1); 1.543 (1.5); 1.524 (2.1); 1.506 (2.9); 1.488 (2.3); 1.406 (1.1); 1.398 (0.6); 1.336 (0.8); 1.299 (0.8); 1.250 (2.7); 1.236 (3.3); 1.225 (2.7); 1.215 (2.8); 1.201 (2.3); 1.193 (3.8); 1.175 (4.5); 1.157 (2.2); 0.866 (2.9); 0.854 (5.0); 0.848 (6.7); 0.834 (5.9); 0.830 (5.6); 0.826 (4.7); 0.818 (3.9); 0.807 (2.8); 0.789 (0.7); 0.000 (0.5)

实施例 I-11: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.054 (4.2); 8.023 (4.8); 7.511 (0.9); 7.507 (1.0); 7.503 (1.1); 7.494 (1.3); 7.486 (1.8); 7.466 (1.4); 7.462 (1.3); 7.451 (5.8); 7.447 (4.8); 7.436 (0.7); 7.432 (0.8); 7.425 (1.1); 7.419 (1.7); 7.413 (1.0); 7.402 (2.0); 7.394 (0.8); 7.385 (0.8); 7.378 (0.8); 7.268 (1.2); 7.244 (1.1); 7.218 (0.8); 7.212 (0.6); 7.205 (0.5); 7.137 (0.8); 7.111 (0.6); 7.083 (1.8); 7.077 (1.3); 7.069 (1.3); 7.058 (2.9); 6.947 (0.8); 6.942 (0.6); 6.934 (0.5); 6.834 (2.4); 6.789 (3.2); 6.008 (0.7); 5.999 (0.9); 5.989 (0.8); 5.980 (1.6); 5.971 (1.0); 5.961 (0.7); 5.951 (0.9); 5.756 (0.8); 4.453 (0.5); 4.420 (0.6); 4.398 (0.4); 4.366 (0.4); 4.257 (0.4); 4.248 (0.9); 4.240 (1.1); 4.230 (3.2); 4.226 (1.9); 4.223 (2.1); 4.213 (3.5); 4.208 (1.9); 4.205 (1.9); 4.195 (1.3); 4.191 (0.7); 4.178 (0.3); 4.038 (0.5); 4.020 (0.5); 3.994 (0.6); 3.968 (1.1); 3.950 (0.8); 3.941 (1.0); 3.925 (1.4); 3.897 (0.9); 3.795 (0.4); 3.761 (0.5); 3.744 (0.5); 3.707 (0.5); 3.553 (12.6); 3.547 (16.0); 3.365 (0.5); 3.358 (1.1); 3.338 (2.5); 3.324 (43.3); 3.295 (1.6); 3.274 (1.1); 3.236 (0.7); 3.206 (0.4); 2.956 (0.5); 2.925 (0.7); 2.893 (1.0); 2.869 (0.5); 2.861 (0.5); 2.671 (0.3); 2.525 (1.0); 2.511 (18.8); 2.507 (37.5); 2.502 (49.9); 2.497 (36.6); 2.493 (17.5); 2.329 (0.3); 2.120 (0.4); 2.085 (0.7); 2.051 (0.5); 1.989 (2.2); 1.952 (0.4); 1.856 (0.7); 1.850 (0.7); 1.825 (0.8); 1.504 (0.4); 1.495 (0.5); 1.473 (0.4); 1.464 (0.4); 1.222 (4.0); 1.217 (3.0); 1.205

[0478]

(8.3); 1.199 (5.9); 1.193 (1.2); 1.187 (3.9); 1.182 (2.8); 1.175 (1.2); 1.157 (0.5); 0.918 (0.4); 0.910 (0.4); 0.888 (0.4); 0.879 (0.4); 0.800 (0.5)
实施例 I-12: ¹ H-NMR (601.6 MHz, CD ₃ CN):
δ= 7.926 (1.3); 7.725 (1.8); 7.695 (1.7); 7.617 (0.8); 7.615 (0.8); 7.582 (0.8); 7.581 (0.7); 7.558 (0.6); 7.546 (1.1); 7.533 (0.6); 7.439 (0.5); 7.436 (0.7); 7.434 (0.6); 7.426 (2.6); 7.422 (1.7); 7.416 (0.4); 7.403 (0.4); 7.399 (0.5); 7.396 (0.5); 7.391 (0.6); 7.386 (0.6); 7.383 (0.5); 6.050 (1.5); 6.024 (1.4); 6.017 (0.4); 6.003 (0.8); 5.998 (0.5); 5.990 (0.5); 5.985 (0.8); 5.971 (0.4); 4.512 (0.4); 4.278 (0.8); 4.270 (0.7); 4.266 (2.3); 4.259 (0.8); 4.254 (2.3); 4.247 (0.3); 4.242 (0.8); 4.065 (0.3); 4.053 (0.3); 3.950 (0.4); 3.932 (0.4); 3.922 (0.7); 3.904 (0.6); 3.895 (0.5); 3.876 (0.6); 3.383 (0.4); 3.369 (0.6); 3.357 (0.8); 3.354 (0.9); 3.350 (0.6); 3.344 (0.8); 3.340 (0.9); 3.335 (0.9); 3.329 (1.0); 3.324 (7.3); 3.317 (6.1); 3.237 (0.3); 2.905 (0.3); 2.887 (16.0); 2.771 (13.5); 2.770 (13.2); 2.750 (0.6); 2.749 (0.6); 2.352 (5.4); 2.346 (5.8); 2.338 (0.6); 2.163 (10.1); 2.137 (0.5); 1.971 (1.5); 1.964 (0.3); 1.956 (0.6); 1.952 (0.7); 1.948 (3.3); 1.944 (5.6); 1.940 (7.8); 1.935 (5.2); 1.931 (2.8); 1.275 (1.4); 1.269 (1.6); 1.263 (2.9); 1.257 (3.0); 1.252 (1.5); 1.245 (1.6); 1.228 (0.4); 1.215 (0.5); 1.203 (0.8); 1.191 (0.4); 0.000 (2.6)
实施例 I-13: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO):
δ= 10.176 (12.1); 8.316 (0.4); 8.034 (3.5); 8.011 (9.1); 7.978 (5.8); 7.977 (6.0); 7.730 (1.0); 7.726 (0.9); 7.717 (1.8); 7.711 (2.7); 7.707 (2.3); 7.698 (1.4); 7.692 (1.9); 7.688 (1.6); 7.625 (2.5); 7.607 (6.2); 7.588 (3.4); 7.579 (1.8); 7.393 (1.1); 7.365 (0.9); 7.260 (1.8); 7.232 (1.7); 7.214 (1.1); 7.203 (0.8); 7.189 (0.7); 7.128 (1.3); 7.100 (1.0); 7.079 (2.6); 7.067 (1.8); 7.045 (5.7); 6.944 (1.2); 6.932 (0.9); 6.918 (0.8); 6.786 (3.5); 6.720 (4.8); 6.437 (1.2); 6.432 (1.5); 6.422 (1.3); 6.416 (1.7); 6.410 (1.4); 6.405 (1.6); 6.394 (1.2); 6.389 (1.5); 5.757 (1.2); 5.046 (0.5); 5.040 (0.7); 5.031 (1.3); 5.024 (1.8); 5.015 (1.8); 5.009 (2.4); 5.000 (1.4); 4.993 (1.8); 4.984 (0.5); 4.978 (0.7); 4.445 (0.9); 4.411 (0.9); 4.381 (0.7); 4.348 (0.7); 4.086 (0.9); 4.058 (2.2); 4.042 (1.2); 4.031 (1.6); 4.015 (2.5); 3.987 (1.4); 3.783 (0.6); 3.750 (0.7); 3.716 (0.8); 3.680 (0.9); 3.568 (2.6); 3.323 (52.8); 3.305 (1.3); 3.296 (1.5); 3.286 (1.1); 3.276 (0.7); 3.267 (0.7); 3.245 (0.7); 3.209 (1.8); 3.190 (2.5); 3.174 (2.0); 3.165 (1.1); 3.147 (2.1); 3.130 (1.6); 2.971 (0.4); 2.965 (0.5); 2.937 (0.8); 2.908 (1.4); 2.876 (1.9); 2.845 (1.0); 2.680 (0.4); 2.676 (0.8); 2.671 (1.1); 2.667 (0.8); 2.662 (0.4); 2.541 (9.4); 2.524 (3.2); 2.511 (66.0); 2.507 (133.0); 2.502 (174.8);

[0479]

2.497 (125.9); 2.493 (60.4); 2.333 (0.9); 2.329 (1.2); 2.324 (0.9); 2.098 (0.6); 2.061 (1.2); 2.023 (0.9); 1.950 (0.4); 1.925 (0.7); 1.845 (0.6); 1.817 (1.2); 1.786 (1.0); 1.597 (0.5); 1.569 (0.5); 1.508 (0.4); 1.487 (0.7); 1.477 (0.8); 1.456 (0.8); 1.446 (0.7); 1.219 (15.6); 1.207 (15.4); 1.204 (16.0); 1.196 (9.0); 0.889 (0.7); 0.878 (0.7); 0.855 (0.7); 0.847 (0.7); 0.000 (2.9)
实施例 I-14: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 10.177 (15.4); 8.034 (4.9); 8.012 (11.3); 7.979 (7.7); 7.731 (1.4); 7.717 (2.5); 7.712 (3.6); 7.693 (2.6); 7.626 (3.3); 7.607 (8.4); 7.589 (4.7); 7.580 (2.6); 7.398 (1.6); 7.375 (1.2); 7.264 (2.6); 7.242 (2.3); 7.218 (1.5); 7.206 (1.0); 7.193 (1.0); 7.132 (1.7); 7.109 (1.3); 7.082 (3.4); 7.071 (2.5); 7.053 (8.0); 6.947 (1.6); 6.936 (1.1); 6.922 (1.0); 6.828 (4.8); 6.809 (0.3); 6.782 (6.4); 6.434 (2.0); 6.423 (1.8); 6.418 (2.3); 6.412 (2.0); 6.406 (2.2); 6.395 (1.7); 6.390 (2.0); 4.440 (1.2); 4.407 (1.4); 4.385 (1.0); 4.351 (1.0); 4.255 (0.9); 4.245 (2.0); 4.238 (2.4); 4.228 (6.3); 4.221 (5.1); 4.210 (6.8); 4.204 (4.8); 4.192 (2.8); 4.176 (0.7); 4.086 (1.3); 4.060 (2.8); 4.043 (1.8); 4.038 (2.4); 4.033 (2.2); 4.020 (2.6); 4.016 (3.3); 4.003 (0.8); 3.989 (1.8); 3.784 (0.9); 3.732 (1.3); 3.695 (1.3); 3.325 (55.8); 3.303 (2.2); 3.273 (1.1); 3.262 (1.1); 3.255 (1.0); 3.224 (1.7); 3.213 (1.8); 3.192 (3.3); 3.176 (2.4); 3.169 (1.6); 3.149 (2.4); 3.132 (2.0); 2.975 (0.7); 2.946 (1.2); 2.914 (1.8); 2.882 (2.4); 2.857 (1.1); 2.850 (1.3); 2.676 (0.5); 2.672 (0.7); 2.668 (0.5); 2.507 (79.1); 2.503 (103.8); 2.498 (77.8); 2.334 (0.5); 2.329 (0.7); 2.325 (0.5); 2.102 (0.8); 2.065 (1.6); 2.028 (1.2); 1.990 (7.2); 1.960 (0.7); 1.933 (1.1); 1.862 (0.4); 1.833 (1.8); 1.801 (1.7); 1.626 (0.3); 1.596 (0.7); 1.575 (0.7); 1.567 (0.7); 1.519 (0.4); 1.509 (0.5); 1.488 (1.0); 1.478 (1.1); 1.457 (1.0); 1.447 (1.0); 1.427 (0.4); 1.416 (0.3); 1.397 (2.4); 1.337 (0.4); 1.250 (0.5); 1.230 (0.9); 1.220 (7.9); 1.212 (5.9); 1.202 (16.0); 1.194 (11.2); 1.185 (8.0); 1.175 (7.7); 1.157 (2.0); 0.933 (0.3); 0.924 (0.4); 0.902 (0.9); 0.895 (1.0); 0.871 (1.0); 0.864 (0.9); 0.841 (0.4); 0.008 (0.8); 0.000 (22.1); -0.008 (1.0)
实施例 I-15: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.011 (6.5); 7.980 (6.2); 7.401 (1.2); 7.376 (1.0); 7.342 (1.7); 7.321 (5.3); 7.313 (2.9); 7.301 (4.7); 7.294 (2.9); 7.268 (2.4); 7.243 (2.1); 7.218 (1.4); 7.214 (1.1); 7.207 (1.0); 7.149 (4.8); 7.136 (1.9); 7.128 (4.1); 7.111 (1.2); 7.096 (0.4); 7.083 (3.3); 7.078 (2.4); 7.071 (2.3); 7.057 (5.9); 7.014 (2.1); 6.996 (3.6); 6.977 (1.6); 6.948 (1.6); 6.943 (1.2); 6.936 (1.0); 6.833 (4.1); 6.787 (5.3); 5.884 (1.2); 5.876 (1.5); 5.867 (1.4); 5.857 (2.7); 5.848 (1.7); 5.839 (1.2); 5.830 (1.5); 4.879 (6.3); 4.874 (12.5); 4.868 (8.0); 4.448 (0.9); 4.416 (1.1); 4.396 (0.9); 4.362 (0.8); 4.257 (0.7); 4.248 (1.7); 4.244 (1.3); 4.239 (1.9); 4.230 (5.4); 4.222 (3.8); 4.212 (5.9); 4.204 (3.3); 4.194 (2.4); 4.187 (1.1);

[0480]

4.177 (0.6); 4.056 (0.5); 4.038 (1.5); 4.020 (1.5); 4.003 (0.5); 3.894 (1.0); 3.867 (2.2); 3.851 (1.4); 3.840 (1.7); 3.825 (2.6); 3.797 (2.1); 3.759 (0.9); 3.741 (1.0); 3.586 (1.5); 3.580 (3.5); 3.572 (4.4); 3.566 (1.9); 3.355 (0.8); 3.345 (1.1); 3.325 (61.6); 3.298 (1.2); 3.288 (1.0); 3.277 (0.7); 3.262 (2.0); 3.243 (2.6); 3.224 (2.4); 3.220 (1.7); 3.200 (2.6); 3.181 (1.4); 2.981 (0.5); 2.952 (0.9); 2.921 (1.3); 2.889 (1.8); 2.864 (0.9); 2.856 (0.9); 2.676 (0.4); 2.671 (0.6); 2.667 (0.4); 2.524 (1.7); 2.511 (34.4); 2.507 (69.0); 2.502 (90.9); 2.497 (66.4); 2.493 (32.6); 2.333 (0.5); 2.329 (0.6); 2.324 (0.5); 2.114 (0.7); 2.078 (1.4); 2.041 (1.0); 1.989 (6.7); 1.975 (0.6); 1.946 (0.8); 1.870 (0.4); 1.844 (1.4); 1.818 (1.4); 1.615 (0.6); 1.607 (0.6); 1.585 (0.6); 1.577 (0.6); 1.521 (0.3); 1.491 (0.8); 1.461 (0.7); 1.397 (1.7); 1.337 (0.5); 1.250 (0.7); 1.232 (0.7); 1.221 (8.0); 1.204 (16.0); 1.193 (3.1); 1.186 (7.8); 1.175 (3.9); 1.157 (1.8); 0.938 (0.3); 0.916 (0.7); 0.909 (0.8); 0.887 (0.7); 0.878 (0.7); 0.854 (0.4); 0.008 (0.7); 0.000 (21.8); -0.009 (0.8)

实施例 I-16: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 7.958 (7.2); 7.931 (9.4); 7.407 (3.7); 7.387 (6.2); 7.366 (3.9); 7.272 (2.4); 7.247 (2.1); 7.221 (1.6); 7.216 (1.5); 7.158 (5.8); 7.149 (6.6); 7.138 (5.8); 7.129 (5.6); 7.115 (1.4); 7.086 (3.6); 7.080 (3.3); 7.063 (4.9); 6.950 (1.7); 6.945 (1.6); 6.837 (4.5); 6.795 (5.9); 6.231 (1.3); 6.219 (1.7); 6.206 (1.7); 6.200 (1.8); 6.194 (2.3); 6.188 (2.0); 6.176 (1.4); 6.163 (1.7); 4.833 (0.3); 4.826 (0.6); 4.819 (0.5); 4.793 (3.2); 4.785 (7.8); 4.779 (8.5); 4.772 (3.9); 4.745 (0.4); 4.738 (0.6); 4.731 (0.4); 4.456 (1.0); 4.423 (1.2); 4.401 (0.9); 4.368 (0.8); 4.260 (0.8); 4.250 (1.7); 4.242 (2.1); 4.233 (5.7); 4.228 (3.9); 4.225 (4.2); 4.215 (6.3); 4.210 (3.9); 4.207 (3.8); 4.197 (2.6); 4.180 (0.6); 4.038 (0.8); 4.020 (0.8); 3.804 (0.8); 3.758 (2.0); 3.731 (1.8); 3.727 (2.1); 3.716 (2.7); 3.701 (1.8); 3.690 (2.5); 3.659 (1.7); 3.575 (1.5); 3.551 (3.2); 3.533 (1.3); 3.526 (2.0); 3.509 (2.2); 3.484 (1.2); 3.440 (1.5); 3.434 (3.2); 3.429 (1.7); 3.419 (1.9); 3.415 (3.5); 3.409 (1.9); 3.373 (0.9); 3.365 (1.0); 3.355 (1.1); 3.345 (1.9); 3.336 (2.3); 3.322 (41.9); 3.309 (1.3); 3.277 (0.8); 3.247 (1.4); 3.217 (0.7); 2.998 (0.5); 2.969 (1.0); 2.942 (1.7); 2.910 (2.1); 2.891 (4.1); 2.878 (1.2); 2.732 (3.0); 2.675 (0.6); 2.671 (0.8); 2.666 (0.6); 2.524 (2.6); 2.510 (49.6); 2.506 (97.3); 2.502 (126.8); 2.497 (92.8); 2.493 (46.4); 2.333 (0.7); 2.328 (0.9); 2.324 (0.7); 2.140 (0.7); 2.104 (1.6); 2.069 (1.1); 1.996 (0.7); 1.989 (3.8); 1.973 (0.9); 1.882 (1.2); 1.854 (1.5); 1.639 (0.7); 1.608 (0.6); 1.541 (0.4); 1.518 (0.8); 1.509 (0.9); 1.487 (0.8); 1.479 (0.8); 1.455 (0.3); 1.398 (1.9); 1.336 (0.7); 1.250 (0.9); 1.224 (7.9); 1.220 (6.6); 1.206 (16.0); 1.202 (13.0); 1.188 (7.9); 1.184 (6.3); 1.175 (2.2); 1.157 (1.0); 0.973 (0.3); 0.945 (0.8); 0.914 (0.8); 0.890 (0.4); 0.146 (0.4); 0.008 (3.0); 0.000 (76.4); -0.008 (3.4); -0.150 (0.4)

[0481]

实施例 I-17: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ = 8.040 (3.7); 8.009 (5.0); 7.590 (0.7); 7.569 (1.6); 7.553 (1.6); 7.532 (0.9); 7.403 (0.7); 7.373 (0.5); 7.346 (1.1); 7.328 (3.6); 7.309 (2.5);
 7.299 (1.1); 7.271 (1.2); 7.241 (1.1); 7.219 (0.8); 7.211 (0.7); 7.138 (0.8); 7.108 (0.6); 7.083 (1.7); 7.076 (1.4); 7.072 (1.3); 7.056 (2.6);
 6.948 (0.8); 6.940 (0.7); 6.937 (0.6); 6.798 (2.3); 6.733 (3.1); 6.049 (0.6); 6.038 (0.7); 6.026 (0.8); 6.016 (1.2); 6.008 (0.9); 5.996 (0.7);
 5.985 (0.8); 5.045 (0.4); 5.037 (0.8); 5.030 (1.1); 5.021 (1.1); 5.014 (1.4); 5.006 (0.9); 4.998 (1.0); 4.990 (0.4); 4.983 (0.4); 4.462 (0.6);
 4.430 (0.6); 4.402 (0.5); 4.369 (0.5); 4.038 (0.9); 4.020 (0.9); 3.897 (0.4); 3.870 (0.8); 3.852 (0.5); 3.842 (0.6); 3.827 (1.0); 3.798 (0.8);
 3.769 (0.5); 3.736 (0.7); 3.702 (0.6); 3.560 (0.7); 3.548 (11.5); 3.541 (14.3); 3.528 (0.8); 3.505 (1.3); 3.483 (1.3); 3.462 (1.2); 3.439 (1.0);
 3.405 (6.2); 3.362 (0.9); 3.351 (0.9); 3.343 (0.8); 3.334 (1.0); 3.324 (0.7); 3.315 (0.5); 3.305 (0.4); 3.267 (0.5); 3.235 (0.8); 3.206 (0.5);
 2.957 (0.6); 2.930 (0.9); 2.898 (1.3); 2.891 (2.4); 2.869 (0.7); 2.732 (1.5); 2.671 (0.4); 2.565 (0.5); 2.524 (1.2); 2.507 (56.4); 2.502 (72.2);
 2.498 (51.5); 2.333 (0.4); 2.329 (0.5); 2.324 (0.4); 2.137 (0.4); 2.098 (0.8); 2.064 (0.6); 1.989 (4.0); 1.962 (0.5); 1.868 (0.7); 1.835 (0.7);
 1.648 (0.6); 1.626 (0.8); 1.603 (0.4); 1.511 (0.5); 1.501 (0.4); 1.489 (0.3); 1.479 (0.5); 1.398 (1.0); 1.224 (16.0); 1.208 (15.9); 1.193 (1.6);
 1.175 (2.1); 1.157 (1.0); 0.919 (0.5); 0.888 (0.5); 0.008 (1.6); 0.000 (42.7); -0.009 (1.4)

实施例 I-18: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ = 14.144 (1.2); 8.316 (0.9); 7.977 (5.3); 7.942 (10.0); 7.432 (1.6); 7.415 (3.0); 7.411 (3.7); 7.394 (3.7); 7.373 (2.3); 7.356 (2.4); 7.284
 (2.0); 7.242 (1.2); 7.235 (1.3); 7.221 (4.8); 7.212 (1.7); 7.204 (1.5); 7.173 (2.4); 7.153 (1.5); 7.110 (0.7); 7.102 (0.7); 7.085 (2.6); 7.076
 (3.2); 7.065 (5.9); 7.060 (5.7); 7.036 (4.8); 7.008 (5.6); 6.987 (5.1); 6.942 (1.6); 6.934 (1.5); 6.906 (3.4); 6.901 (3.0); 6.880 (3.9); 6.873
 (3.0); 6.859 (4.2); 6.850 (5.8); 6.763 (4.9); 6.072 (1.2); 6.059 (1.5); 6.050 (1.5); 6.037 (2.0); 6.028 (1.7); 6.019 (1.4); 6.006 (1.4); 4.885
 (0.4); 4.879 (0.4); 4.839 (12.2); 4.825 (2.5); 4.808 (2.1); 4.467 (1.0); 4.435 (1.2); 4.406 (0.9); 4.375 (0.8); 4.038 (0.9); 4.020 (0.9); 3.815
 (0.7); 3.802 (1.3); 3.775 (1.2); 3.759 (1.3); 3.746 (1.4); 3.733 (2.4); 3.703 (1.8); 3.586 (0.3); 3.536 (1.8); 3.531 (3.8); 3.525 (3.7); 3.521
 (4.7); 3.520 (4.8); 3.495 (2.5); 3.472 (1.9); 3.452 (1.9); 3.429 (1.2); 3.357 (1.4); 3.349 (1.3); 3.323 (90.3); 3.302 (0.9); 3.272 (0.8); 3.240
 (1.3); 3.210 (0.8); 2.996 (0.7); 2.968 (0.8); 2.931 (1.3); 2.899 (2.2); 2.891 (1.8); 2.870 (1.2); 2.731 (0.5); 2.680 (0.6); 2.676 (1.4); 2.671
 (1.9); 2.666 (1.4); 2.662 (0.6); 2.524 (5.2); 2.520 (8.3); 2.511 (114.1); 2.507 (233.2); 2.502 (308.0); 2.497 (219.0); 2.493 (103.1); 2.421

[0482]

(0.5); 2.338 (0.8); 2.333 (1.6); 2.329 (2.1); 2.324 (1.6); 2.320 (0.8); 2.139 (1.0); 2.095 (1.3); 2.060 (1.1); 1.989 (4.4); 1.964 (0.9); 1.888 (0.4); 1.854 (1.4); 1.825 (1.5); 1.619 (1.1); 1.613 (1.1); 1.600 (1.5); 1.594 (1.5); 1.581 (2.1); 1.577 (2.3); 1.564 (2.7); 1.558 (2.5); 1.546 (3.6); 1.526 (4.5); 1.508 (6.2); 1.491 (5.1); 1.398 (5.2); 1.298 (1.8); 1.236 (7.2); 1.226 (6.4); 1.217 (6.7); 1.196 (5.4); 1.193 (5.8); 1.175 (4.7); 1.157 (2.2); 0.868 (6.2); 0.855 (11.5); 0.849 (16.0); 0.836 (13.7); 0.831 (14.1); 0.822 (11.6); 0.805 (5.1); 0.008 (0.5); 0.000 (17.6); -0.009 (0.5)
实施例 I-19: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.051 (3.7); 8.030 (5.0); 7.513 (0.9); 7.498 (1.5); 7.484 (1.8); 7.467 (1.4); 7.463 (1.6); 7.451 (5.3); 7.448 (5.9); 7.434 (1.0); 7.424 (1.0); 7.418 (1.5); 7.413 (0.9); 7.402 (1.4); 7.384 (0.6); 7.378 (0.4); 6.739 (2.5); 6.717 (3.4); 6.625 (3.6); 6.618 (1.8); 6.008 (0.7); 6.000 (0.9); 5.989 (0.8); 5.980 (1.7); 5.972 (1.0); 5.961 (0.7); 5.952 (0.9); 4.481 (0.6); 4.448 (0.6); 4.405 (0.4); 4.372 (0.4); 4.272 (0.5); 4.264 (0.9); 4.254 (1.5); 4.247 (2.7); 4.240 (2.1); 4.236 (1.8); 4.229 (2.9); 4.222 (1.8); 4.212 (1.1); 4.204 (0.6); 4.038 (0.7); 4.020 (0.7); 3.994 (0.6); 3.967 (1.1); 3.950 (0.8); 3.940 (0.9); 3.924 (1.3); 3.897 (0.8); 3.683 (0.4); 3.649 (0.9); 3.615 (0.6); 3.553 (11.9); 3.547 (16.0); 3.358 (0.9); 3.334 (2.2); 3.325 (31.8); 3.315 (2.9); 3.295 (1.3); 3.291 (1.4); 3.271 (0.9); 3.225 (0.5); 3.194 (0.8); 3.164 (0.4); 2.919 (0.8); 2.891 (2.3); 2.863 (0.6); 2.855 (0.8); 2.732 (0.9); 2.525 (0.9); 2.511 (17.7); 2.507 (35.2); 2.502 (46.8); 2.498 (34.8); 2.493 (17.3); 2.329 (0.3); 2.269 (9.9); 2.250 (7.2); 2.093 (0.8); 2.071 (0.6); 1.989 (3.0); 1.928 (0.4); 1.828 (0.7); 1.798 (0.7); 1.609 (0.3); 1.476 (0.5); 1.466 (0.3); 1.445 (0.5); 1.337 (0.7); 1.250 (1.2); 1.244 (5.0); 1.226 (10.0); 1.208 (4.9); 1.193 (1.1); 1.175 (1.7); 1.157 (0.8); 0.917 (0.5); 0.886 (0.4); 0.000 (0.4)
实施例 I-20: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.051 (2.8); 8.027 (3.3); 7.953 (0.5); 7.509 (0.9); 7.504 (0.8); 7.488 (1.4); 7.468 (1.0); 7.464 (1.2); 7.453 (4.0); 7.448 (4.6); 7.434 (0.8); 7.422 (1.2); 7.418 (0.9); 7.405 (1.1); 7.389 (0.5); 7.383 (0.4); 6.636 (2.0); 6.624 (2.5); 6.007 (0.6); 6.001 (0.7); 5.988 (0.7); 5.980 (1.2); 5.973 (0.8); 5.960 (0.6); 5.953 (0.7); 4.437 (0.4); 4.406 (0.7); 4.375 (0.4); 4.248 (0.8); 4.231 (2.2); 4.214 (2.3); 4.196 (0.9); 3.994 (0.7); 3.977 (0.6); 3.965 (0.6); 3.949 (1.0); 3.932 (0.6); 3.922 (0.6); 3.904 (0.5); 3.725 (0.4); 3.704 (0.5); 3.675 (0.4); 3.552 (16.0); 3.358 (0.9); 3.340 (1.5); 3.324 (39.0); 3.297 (1.3); 3.278 (0.7); 3.191 (0.5); 2.939 (0.4); 2.910 (0.7); 2.891 (3.8); 2.879 (0.9); 2.849 (0.5); 2.731 (2.8);

[0483]

2.671 (0.3); 2.524 (0.9); 2.511 (18.5); 2.507 (37.0); 2.502 (49.3); 2.497 (37.1); 2.493 (18.7); 2.329 (0.4); 2.284 (6.8); 2.263 (6.6); 2.250 (0.5); 2.178 (6.5); 2.167 (4.1); 2.155 (3.9); 2.119 (0.4); 2.081 (0.7); 2.048 (0.4); 1.989 (0.9); 1.950 (0.4); 1.857 (0.4); 1.825 (0.6); 1.511 (0.3); 1.336 (0.5); 1.299 (0.4); 1.259 (0.6); 1.250 (0.8); 1.241 (3.3); 1.238 (3.2); 1.223 (6.3); 1.220 (5.4); 1.205 (3.1); 1.202 (2.6); 1.191 (0.7); 1.175 (0.6); 0.000 (0.4)

实施例 I-21: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 10.178 (5.6); 8.035 (1.5); 8.019 (2.8); 8.017 (2.8); 7.978 (2.6); 7.731 (0.7); 7.712 (1.6); 7.693 (1.2); 7.626 (1.2); 7.605 (3.2); 7.586 (1.7); 7.411 (0.5); 7.277 (0.8); 7.230 (0.4); 7.224 (0.5); 7.209 (0.5); 7.146 (0.6); 7.088 (0.3); 7.074 (1.2); 7.050 (3.0); 6.938 (0.5); 6.880 (0.6); 6.868 (0.8); 6.860 (0.6); 6.752 (2.0); 6.440 (0.6); 6.434 (0.7); 6.424 (0.7); 6.418 (0.9); 6.407 (0.8); 6.396 (0.6); 6.391 (0.7); 4.817 (1.0); 4.804 (0.8); 4.451 (0.5); 4.418 (0.5); 4.389 (0.4); 4.357 (0.4); 4.087 (0.4); 4.060 (1.0); 4.043 (0.5); 4.032 (0.7); 4.016 (1.1); 3.989 (0.6); 3.709 (0.4); 3.676 (0.4); 3.326 (14.8); 3.294 (0.7); 3.255 (0.4); 3.220 (0.6); 3.201 (0.6); 3.191 (1.2); 3.175 (0.9); 3.158 (0.5); 3.147 (0.9); 3.131 (0.7); 2.907 (0.5); 2.891 (1.1); 2.875 (1.0); 2.845 (0.5); 2.732 (0.7); 2.508 (29.1); 2.503 (37.8); 2.499 (27.8); 2.101 (0.3); 2.062 (0.5); 2.023 (0.5); 1.925 (0.3); 1.806 (0.6); 1.776 (0.5); 1.597 (0.5); 1.579 (0.8); 1.569 (0.9); 1.560 (1.1); 1.540 (1.5); 1.522 (2.1); 1.515 (1.8); 1.504 (2.4); 1.486 (2.3); 1.469 (1.2); 1.451 (0.7); 1.396 (16.0); 1.337 (0.6); 1.278 (1.0); 1.249 (2.2); 1.235 (2.5); 1.223 (2.3); 1.214 (2.4); 1.193 (2.1); 0.864 (2.8); 0.852 (4.8); 0.846 (5.9); 0.833 (5.3); 0.827 (4.8); 0.815 (3.4); 0.806 (3.1); 0.788 (1.7); 0.771 (0.5); 0.008 (0.6); 0.000 (15.4); -0.008 (0.6)

实施例 I-22: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.208 (0.6); 8.034 (6.0); 7.590 (0.6); 7.574 (0.7); 7.569 (1.2); 7.553 (1.3); 7.548 (0.8); 7.532 (0.7); 7.346 (0.9); 7.329 (2.4); 7.322 (1.2); 7.308 (1.8); 7.300 (0.8); 6.045 (0.7); 6.022 (0.8); 6.015 (0.8); 5.992 (0.7); 4.756 (0.6); 4.742 (0.8); 4.728 (0.6); 4.447 (0.5); 4.414 (0.5); 4.038 (0.7); 4.020 (0.7); 3.896 (0.9); 3.865 (1.0); 3.862 (0.9); 3.853 (0.8); 3.848 (0.7); 3.822 (0.5); 3.818 (0.5); 3.645 (0.7); 3.606 (1.2); 3.546 (16.0); 3.523 (1.9); 3.500 (0.9); 3.490 (0.5); 3.482 (1.1); 3.457 (0.6); 3.390 (0.4); 3.371 (0.5); 3.361 (0.8); 3.353 (0.4); 3.322 (14.9); 3.234 (0.4); 3.204 (0.7); 3.175 (0.4); 2.799 (0.4); 2.770 (0.7); 2.741 (0.4); 2.732 (0.4); 2.671 (0.4); 2.524 (0.8); 2.520 (1.3); 2.511 (19.1); 2.507 (39.4); 2.502 (52.3); 2.497 (37.8); 2.493 (18.2); 2.329 (0.3); 2.089 (0.9); 1.989 (2.9); 1.744 (0.5); 1.713 (0.4); 1.574 (0.5);

[0484]

1.558 (0.8); 1.545 (0.9); 1.539 (1.2); 1.527 (1.0); 1.517 (1.2); 1.507 (1.2); 1.499 (2.0); 1.481 (2.0); 1.463 (1.1); 1.446 (0.4); 1.231 (2.6); 1.216 (2.4); 1.193 (1.7); 1.175 (1.9); 1.157 (0.9); 0.849 (4.2); 0.839 (2.6); 0.831 (9.4); 0.813 (4.0); 0.000 (2.3)
实施例 I-23: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.038 (2.5); 8.035 (2.5); 7.590 (0.5); 7.574 (0.7); 7.569 (1.2); 7.554 (1.2); 7.549 (0.9); 7.533 (0.7); 7.348 (0.9); 7.330 (2.8); 7.309 (1.9); 7.302 (1.0); 6.046 (0.7); 6.023 (0.9); 6.017 (0.9); 5.993 (0.8); 5.934 (1.5); 5.894 (1.6); 5.004 (0.3); 4.989 (0.9); 4.973 (1.2); 4.958 (0.9); 4.942 (0.4); 4.381 (0.5); 4.353 (0.5); 4.056 (0.4); 4.038 (1.0); 4.020 (1.0); 4.003 (0.8); 3.972 (0.3); 3.899 (0.5); 3.868 (0.6); 3.864 (0.6); 3.855 (0.7); 3.851 (0.7); 3.821 (0.6); 3.547 (16.0); 3.528 (1.0); 3.504 (0.9); 3.484 (0.8); 3.460 (1.1); 3.430 (5.2); 3.379 (0.5); 3.369 (0.4); 3.282 (0.6); 3.247 (0.6); 2.908 (0.5); 2.876 (0.5); 2.565 (5.7); 2.524 (0.8); 2.511 (15.3); 2.507 (30.3); 2.502 (39.4); 2.498 (28.7); 2.493 (14.3); 2.121 (0.9); 2.099 (0.8); 1.989 (3.5); 1.979 (0.5); 1.750 (0.4); 1.646 (0.6); 1.574 (0.3); 1.543 (0.5); 1.237 (3.7); 1.233 (3.4); 1.222 (3.8); 1.217 (3.6); 1.210 (3.6); 1.202 (3.6); 1.194 (3.9); 1.186 (3.5); 1.175 (2.2); 1.169 (0.7); 1.157 (1.0); 0.008 (2.0); 0.000 (46.0); -0.009 (2.1)
实施例 I-24: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.316 (0.4); 8.021 (0.9); 7.979 (0.3); 7.971 (2.5); 7.965 (3.5); 7.958 (1.1); 7.945 (0.6); 7.432 (1.1); 7.415 (1.9); 7.411 (2.4); 7.394 (2.6); 7.373 (1.2); 7.147 (0.6); 7.009 (3.7); 6.987 (3.5); 6.945 (0.5); 6.933 (0.4); 6.924 (0.5); 6.908 (1.9); 6.887 (2.3); 6.868 (0.7); 6.861 (1.5); 6.080 (0.5); 6.067 (1.2); 6.045 (1.6); 6.037 (1.5); 6.027 (0.6); 6.013 (2.9); 5.997 (0.7); 5.980 (2.2); 5.966 (0.6); 4.964 (1.5); 4.889 (0.4); 4.883 (0.4); 4.849 (4.8); 4.843 (8.4); 4.838 (5.2); 4.803 (0.4); 4.797 (0.4); 4.370 (0.8); 4.345 (0.9); 4.335 (0.8); 4.323 (0.9); 4.312 (0.9); 4.304 (0.9); 4.293 (1.4); 4.281 (1.4); 4.271 (0.8); 4.250 (0.8); 4.239 (1.4); 4.227 (1.6); 4.216 (1.2); 4.210 (1.1); 4.197 (0.9); 4.186 (0.6); 4.171 (0.4); 4.160 (0.4); 4.056 (1.5); 4.038 (3.9); 4.020 (4.4); 4.002 (1.7); 3.984 (0.6); 3.874 (0.4); 3.843 (0.4); 3.830 (0.6); 3.820 (0.5); 3.804 (1.2); 3.790 (0.6); 3.774 (1.3); 3.762 (1.5); 3.732 (1.6); 3.699 (0.3); 3.687 (0.5); 3.674 (0.4); 3.669 (0.4); 3.657 (0.3); 3.635 (0.5); 3.623 (0.6); 3.616 (0.6); 3.593 (0.4); 3.580 (0.9); 3.558 (0.9); 3.541 (3.8); 3.535 (8.3); 3.529 (5.6); 3.526 (5.3); 3.516 (4.6); 3.495 (2.1); 3.475 (1.6); 3.453 (1.5); 3.432 (1.0); 3.403 (1.7); 3.389 (2.1); 3.354 (15.4); 3.292 (1.5); 3.254 (10.5); 3.246 (5.9); 3.231 (1.8); 3.213 (7.5); 3.204 (3.0); 3.175 (0.6); 3.168 (0.6); 3.157 (0.7); 3.146 (0.7); 3.140 (0.5); 2.940 (0.3); 2.913 (0.8); 2.883 (0.8); 2.858 (0.4); 2.805 (0.3);

[0485]

2.798 (0.3); 2.675 (0.6); 2.671 (0.9); 2.666 (0.7); 2.565 (12.6); 2.524 (1.7); 2.519 (3.0); 2.511 (53.4); 2.506 (111.6); 2.502 (149.7); 2.497 (110.7); 2.493 (55.8); 2.411 (0.4); 2.338 (0.5); 2.333 (0.9); 2.329 (1.2); 2.324 (0.9); 2.103 (1.9); 2.025 (1.5); 2.009 (0.6); 1.989 (16.0); 1.909 (1.9); 1.825 (0.3); 1.790 (0.4); 1.763 (0.5); 1.736 (0.6); 1.705 (0.5); 1.673 (0.4); 1.653 (0.4); 1.620 (0.4); 1.612 (0.4); 1.591 (0.6); 1.583 (0.6); 1.562 (0.8); 1.553 (0.8); 1.532 (0.8); 1.523 (0.8); 1.502 (0.6); 1.298 (0.4); 1.259 (0.6); 1.235 (0.7); 1.202 (0.4); 1.193 (4.3); 1.175 (8.5); 1.157 (4.2); 0.008 (0.8); 0.000 (26.7); -0.008 (1.2)

实施例 I-25: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 10.177 (16.0); 8.032 (4.5); 8.011 (9.7); 8.006 (8.2); 7.735 (1.6); 7.732 (1.7); 7.716 (4.6); 7.698 (3.2); 7.694 (3.0); 7.625 (3.4); 7.607 (11.7); 7.588 (6.6); 6.440 (2.8); 6.424 (3.1); 6.412 (3.0); 6.396 (2.8); 5.956 (5.0); 5.932 (5.6); 4.371 (1.1); 4.360 (1.1); 4.343 (1.3); 4.227 (1.0); 4.218 (2.1); 4.210 (2.0); 4.200 (6.6); 4.195 (3.4); 4.192 (3.4); 4.183 (7.0); 4.178 (3.3); 4.174 (2.9); 4.165 (2.8); 4.147 (0.5); 4.084 (2.1); 4.056 (2.6); 4.039 (3.4); 4.021 (2.2); 4.012 (3.0); 4.003 (1.3); 3.990 (1.5); 3.961 (1.0); 3.568 (0.9); 3.400 (0.9); 3.369 (2.2); 3.354 (10.8); 3.304 (0.7); 3.274 (1.3); 3.258 (0.8); 3.244 (0.9); 3.228 (1.3); 3.216 (3.5); 3.200 (3.8); 3.173 (3.0); 3.157 (3.0); 2.923 (0.6); 2.917 (0.7); 2.892 (1.7); 2.861 (1.6); 2.836 (0.6); 2.677 (0.4); 2.672 (0.5); 2.668 (0.4); 2.566 (11.3); 2.525 (1.4); 2.512 (31.1); 2.508 (62.3); 2.503 (81.5); 2.498 (58.4); 2.494 (27.9); 2.334 (0.4); 2.330 (0.5); 2.325 (0.4); 2.087 (2.6); 1.990 (5.0); 1.776 (0.4); 1.755 (0.8); 1.746 (0.8); 1.724 (0.9); 1.713 (0.9); 1.701 (0.8); 1.695 (0.8); 1.671 (0.7); 1.576 (0.3); 1.556 (0.9); 1.546 (1.0); 1.525 (1.3); 1.517 (1.3); 1.494 (0.9); 1.486 (0.9); 1.465 (0.3); 1.259 (0.4); 1.236 (0.6); 1.223 (5.8); 1.216 (5.8); 1.205 (11.5); 1.198 (10.9); 1.193 (3.1); 1.187 (5.7); 1.181 (5.2); 1.175 (3.2); 1.157 (1.4); 0.008 (1.5); 0.000 (42.6); -0.009 (1.4)

实施例 I-26: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 7.970 (6.5); 7.966 (6.9); 7.433 (1.5); 7.415 (2.0); 7.412 (3.3); 7.395 (3.3); 7.391 (2.3); 7.374 (1.7); 7.009 (5.0); 6.988 (4.5); 6.909 (2.5); 6.884 (3.1); 6.862 (2.3); 6.068 (2.0); 6.046 (2.5); 6.038 (2.4); 6.015 (2.1); 5.967 (4.5); 5.941 (4.9); 4.890 (0.5); 4.884 (0.5); 4.850 (7.0); 4.844 (12.1); 4.839 (7.0); 4.804 (0.5); 4.798 (0.5); 4.377 (1.1); 4.354 (1.2); 4.232 (0.6); 4.223 (1.5); 4.214 (1.5); 4.205 (4.8); 4.196 (2.8); 4.187 (5.1); 4.178 (2.5); 4.169 (2.1); 4.151 (0.4); 4.056 (0.7); 4.038 (2.5); 4.020 (2.5); 4.002 (1.9); 3.979 (0.9); 3.805 (1.5); 3.774 (1.7); 3.762 (2.1); 3.732 (1.9); 3.541 (3.1); 3.535 (6.4); 3.529 (3.3); 3.519 (2.2); 3.496 (2.1); 3.476 (1.7); 3.454 (1.7); 3.432 (0.8); 3.404 (1.7);

[0486]

3.375 (0.9); 3.323 (24.2); 3.293 (1.2); 3.264 (0.8); 3.248 (1.1); 3.219 (0.6); 2.938 (0.7); 2.913 (1.5); 2.882 (1.4); 2.858 (0.6); 2.675 (0.3); 2.671 (0.5); 2.666 (0.3); 2.524 (1.4); 2.511 (27.4); 2.506 (54.0); 2.502 (70.5); 2.497 (52.2); 2.333 (0.3); 2.329 (0.5); 2.324 (0.4); 2.126 (2.4); 1.989 (7.6); 1.781 (0.7); 1.757 (0.9); 1.728 (0.9); 1.699 (0.6); 1.588 (0.8); 1.579 (0.8); 1.556 (1.2); 1.549 (1.1); 1.525 (0.9); 1.517 (0.8); 1.397 (0.5); 1.226 (8.0); 1.208 (16.0); 1.191 (8.4); 1.175 (4.1); 1.157 (2.0); 0.008 (1.3); 0.000 (34.5); -0.008 (1.4)
实施例 I-27: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.038 (2.7); 8.035 (2.8); 7.591 (0.5); 7.575 (0.7); 7.570 (1.2); 7.554 (1.2); 7.549 (0.8); 7.533 (0.7); 7.348 (0.9); 7.330 (2.6); 7.309 (1.8); 7.302 (0.9); 6.047 (0.7); 6.024 (0.9); 6.017 (0.9); 5.994 (0.8); 5.966 (1.6); 5.940 (1.8); 4.377 (0.4); 4.360 (0.4); 4.223 (0.6); 4.214 (0.6); 4.205 (1.9); 4.201 (1.1); 4.196 (1.0); 4.187 (2.1); 4.178 (0.9); 4.169 (0.8); 4.056 (0.4); 4.038 (1.5); 4.020 (1.5); 4.003 (0.9); 3.977 (0.3); 3.900 (0.5); 3.869 (0.5); 3.866 (0.5); 3.857 (0.7); 3.853 (0.7); 3.824 (0.6); 3.547 (16.0); 3.530 (0.9); 3.507 (0.9); 3.486 (0.7); 3.463 (0.7); 3.437 (0.3); 3.407 (0.6); 3.378 (0.4); 3.323 (8.7); 3.293 (0.5); 3.247 (0.4); 2.912 (0.5); 2.880 (0.5); 2.566 (1.0); 2.524 (0.5); 2.511 (9.3); 2.507 (18.6); 2.502 (24.4); 2.498 (17.8); 2.493 (8.8); 2.124 (0.9); 2.119 (0.9); 1.989 (5.2); 1.552 (0.4); 1.397 (0.6); 1.226 (2.5); 1.208 (4.9); 1.192 (3.0); 1.175 (2.8); 1.157 (1.4); 0.008 (0.6); 0.000 (16.6); -0.009 (0.6)
实施例 I-28: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 10.177 (13.6); 8.034 (3.1); 8.017 (6.6); 8.006 (4.8); 7.778 (0.4); 7.733 (1.4); 7.730 (1.6); 7.714 (3.8); 7.711 (3.4); 7.695 (2.8); 7.692 (2.7); 7.624 (3.1); 7.606 (8.3); 7.586 (4.5); 6.439 (2.2); 6.423 (2.5); 6.411 (2.4); 6.395 (2.3); 6.034 (1.5); 6.026 (2.8); 5.961 (3.7); 4.778 (1.6); 4.765 (1.5); 4.372 (1.4); 4.340 (1.5); 4.082 (2.9); 4.054 (3.6); 4.038 (6.8); 4.020 (4.5); 4.010 (3.0); 4.003 (1.9); 3.985 (0.8); 3.408 (0.8); 3.400 (0.9); 3.380 (1.7); 3.370 (1.9); 3.346 (12.5); 3.293 (0.8); 3.275 (1.0); 3.262 (1.2); 3.246 (1.3); 3.215 (1.7); 3.198 (1.7); 3.179 (1.2); 3.172 (1.2); 3.154 (1.4); 3.136 (1.0); 2.908 (0.6); 2.891 (1.4); 2.882 (1.3); 2.851 (1.4); 2.823 (0.5); 2.731 (0.7); 2.676 (0.7); 2.671 (1.0); 2.667 (0.7); 2.566 (8.4); 2.546 (0.3); 2.525 (2.3); 2.511 (55.2); 2.507 (112.1); 2.502 (148.5); 2.498 (108.1); 2.493 (52.6); 2.338 (0.4); 2.334 (0.8); 2.329 (1.1); 2.325 (0.8); 2.320 (0.5); 2.091 (2.3); 2.060 (2.5); 1.989 (16.0); 1.789 (0.3); 1.758 (0.7); 1.735 (0.8); 1.727 (0.9); 1.696 (0.9); 1.665 (0.7); 1.632 (0.4); 1.626 (0.5); 1.610 (0.6); 1.591 (1.0); 1.551 (2.2); 1.544 (2.2); 1.509 (4.2); 1.503 (4.2); 1.492 (4.5); 1.474 (3.1); 1.397 (0.6); 1.348 (0.5); 1.298 (2.2); 1.259 (4.6); 1.235 (5.0); 1.221 (3.9); 1.193 (7.5); 1.175 (11.1); 1.157 (6.3); 0.907 (0.4);

[0487]

0.875 (3.3); 0.858 (8.3); 0.839 (7.2); 0.831 (6.1); 0.821 (5.3); 0.812 (4.9); 0.805 (4.8); 0.800 (4.7); 0.793 (4.9); 0.781 (2.6); 0.775 (2.8); 0.761 (1.9); 0.743 (0.9); 0.146 (0.4); 0.008 (3.3); 0.000 (98.9); -0.009 (3.4); -0.150 (0.4)

实施例 I-29: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 10.290 (1.5); 10.177 (15.0); 10.160 (1.0); 8.302 (1.3); 8.141 (0.4); 8.135 (0.4); 8.033 (4.4); 8.010 (9.5); 8.005 (7.7); 7.945 (0.4); 7.928 (0.8); 7.891 (0.4); 7.872 (0.6); 7.785 (0.4); 7.767 (0.6); 7.748 (0.4); 7.735 (1.8); 7.732 (1.8); 7.716 (4.7); 7.697 (3.4); 7.694 (3.1); 7.672 (0.4); 7.625 (3.3); 7.606 (11.8); 7.587 (6.7); 7.449 (0.7); 7.436 (0.7); 6.675 (0.6); 6.439 (2.8); 6.423 (3.1); 6.411 (3.1); 6.395 (2.8); 5.946 (0.6); 5.923 (4.7); 5.885 (5.3); 5.000 (1.2); 4.984 (2.5); 4.969 (3.1); 4.953 (2.2); 4.938 (0.9); 4.369 (1.6); 4.336 (1.6); 4.083 (2.3); 4.055 (2.8); 4.039 (3.9); 4.020 (2.2); 4.012 (3.1); 4.002 (1.4); 3.989 (2.0); 3.954 (1.1); 3.714 (0.3); 3.568 (11.7); 3.399 (1.2); 3.371 (2.5); 3.362 (1.7); 3.335 (30.9); 3.293 (0.9); 3.263 (2.0); 3.228 (2.0); 3.214 (2.3); 3.210 (2.1); 3.198 (2.6); 3.171 (1.8); 3.166 (1.7); 3.155 (1.7); 2.912 (0.9); 2.886 (1.9); 2.856 (1.9); 2.831 (0.7); 2.676 (0.7); 2.672 (1.0); 2.667 (0.7); 2.507 (121.1); 2.503 (151.9); 2.498 (110.7); 2.334 (0.8); 2.329 (1.1); 2.325 (0.8); 2.162 (0.4); 2.149 (0.4); 2.081 (3.2); 1.989 (3.8); 1.790 (0.4); 1.781 (0.5); 1.751 (1.1); 1.728 (1.1); 1.719 (1.3); 1.699 (0.9); 1.688 (0.8); 1.681 (0.8); 1.648 (0.4); 1.640 (0.4); 1.571 (0.5); 1.543 (1.1); 1.513 (1.5); 1.492 (1.1); 1.483 (1.0); 1.462 (0.4); 1.397 (1.0); 1.259 (0.6); 1.246 (3.2); 1.234 (11.4); 1.218 (15.6); 1.204 (13.9); 1.190 (16.0); 1.175 (9.5); 1.157 (1.5); 0.146 (0.4); 0.008 (4.8); 0.000 (98.8); -0.008 (4.2); -0.150 (0.5)

实施例 I-30: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.263 (0.5); 8.010 (7.8); 8.006 (8.2); 7.346 (1.9); 7.342 (2.6); 7.321 (8.5); 7.302 (7.2); 7.273 (0.6); 7.268 (0.3); 7.149 (6.0); 7.129 (5.1); 7.018 (3.4); 6.999 (5.8); 6.981 (2.7); 5.962 (5.5); 5.935 (6.1); 5.883 (2.9); 5.865 (3.3); 5.855 (3.2); 5.837 (2.9); 5.758 (0.9); 4.879 (15.3); 4.873 (15.3); 4.785 (0.5); 4.367 (1.3); 4.350 (1.3); 4.341 (1.4); 4.229 (0.9); 4.220 (2.1); 4.216 (1.5); 4.211 (2.0); 4.202 (6.5); 4.193 (3.5); 4.184 (7.0); 4.175 (3.1); 4.167 (2.9); 4.158 (1.0); 4.148 (0.5); 4.056 (0.6); 4.038 (2.1); 4.020 (2.4); 4.002 (1.9); 3.995 (1.7); 3.965 (1.1); 3.893 (2.6); 3.865 (2.8); 3.850 (3.2); 3.822 (2.8); 3.585 (3.7); 3.579 (7.8); 3.574 (3.6); 3.413 (1.0); 3.384 (2.0); 3.354 (1.2); 3.329 (38.3); 3.311 (1.0); 3.279 (1.6); 3.263 (4.6); 3.245 (4.5); 3.234 (1.4); 3.220 (3.6); 3.203 (3.9); 2.928 (0.7); 2.923 (0.8); 2.897 (1.8); 2.866 (1.8); 2.841 (0.7); 2.676 (0.4); 2.671 (0.6); 2.667 (0.4); 2.525 (1.6); 2.520 (2.5); 2.511 (34.4); 2.507 (69.7); 2.502 (91.9); 2.498 (66.4); 2.493

[0488]

(31.9); 2.334 (0.5); 2.329 (0.6); 2.324 (0.5); 2.100 (2.9); 2.095 (2.8); 1.989 (7.2); 1.795 (0.3); 1.785 (0.4); 1.763 (0.8); 1.754 (0.9); 1.733 (1.0); 1.722 (1.0); 1.706 (0.9); 1.685 (0.8); 1.587 (0.4); 1.566 (1.0); 1.556 (1.1); 1.535 (1.5); 1.526 (1.4); 1.504 (1.0); 1.494 (0.9); 1.474 (0.4); 1.258 (0.4); 1.249 (0.4); 1.224 (8.2); 1.206 (16.0); 1.188 (8.0); 1.175 (4.2); 1.157 (2.0); 0.008 (1.7); 0.000 (51.3); -0.009 (1.7)

实施例 I-31: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 7.956 (5.7); 7.408 (2.8); 7.388 (5.8); 7.367 (4.1); 7.159 (5.5); 7.151 (6.2); 7.138 (4.7); 7.131 (5.2); 6.229 (2.1); 6.204 (2.7); 6.198 (2.6); 6.173 (2.1); 5.966 (4.1); 5.942 (4.6); 5.757 (0.8); 4.834 (0.7); 4.828 (0.7); 4.794 (5.5); 4.786 (7.4); 4.779 (5.4); 4.745 (0.7); 4.739 (0.7); 4.718 (0.3); 4.359 (1.2); 4.232 (0.7); 4.223 (1.6); 4.214 (1.7); 4.205 (4.7); 4.196 (3.0); 4.188 (5.1); 4.179 (2.7); 4.170 (2.2); 4.152 (0.5); 4.056 (0.6); 4.038 (1.9); 4.020 (2.0); 4.002 (1.8); 3.978 (1.0); 3.759 (1.7); 3.728 (2.0); 3.717 (2.8); 3.686 (2.4); 3.575 (2.3); 3.550 (2.3); 3.533 (1.6); 3.508 (1.5); 3.437 (4.7); 3.403 (1.7); 3.374 (1.0); 3.329 (19.8); 3.295 (1.3); 3.249 (1.2); 3.221 (0.6); 2.940 (0.7); 2.915 (1.4); 2.885 (1.3); 2.861 (0.6); 2.675 (0.4); 2.671 (0.5); 2.667 (0.4); 2.565 (1.2); 2.506 (63.4); 2.502 (81.7); 2.498 (61.1); 2.333 (0.5); 2.329 (0.6); 2.126 (2.5); 1.989 (4.9); 1.781 (0.7); 1.760 (0.9); 1.730 (0.9); 1.700 (0.7); 1.589 (0.9); 1.581 (0.8); 1.559 (1.2); 1.552 (1.1); 1.528 (0.9); 1.497 (0.3); 1.397 (0.4); 1.250 (0.5); 1.226 (8.2); 1.208 (16.0); 1.191 (8.4); 1.175 (2.9); 1.157 (1.4); 0.008 (1.9); 0.000 (36.0); -0.007 (1.6)

实施例 I-32: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.260 (1.1); 8.010 (7.4); 8.005 (7.5); 7.990 (0.6); 7.986 (0.6); 7.950 (0.6); 7.946 (0.4); 7.931 (0.4); 7.927 (0.4); 7.547 (0.3); 7.345 (2.3); 7.341 (3.1); 7.321 (8.3); 7.307 (2.2); 7.302 (6.5); 7.300 (6.8); 7.268 (1.6); 7.188 (0.5); 7.149 (6.0); 7.129 (5.1); 7.055 (0.3); 7.036 (0.5); 7.018 (3.7); 6.999 (6.0); 6.980 (2.8); 5.956 (0.5); 5.930 (5.4); 5.911 (0.8); 5.889 (6.3); 5.884 (3.8); 5.865 (3.3); 5.855 (3.2); 5.837 (2.9); 5.077 (0.9); 5.018 (0.3); 5.002 (1.8); 4.987 (3.3); 4.971 (4.2); 4.955 (3.0); 4.940 (1.2); 4.878 (15.9); 4.872 (16.0); 4.784 (0.3); 4.373 (1.6); 4.358 (1.1); 4.342 (1.6); 4.056 (1.1); 4.038 (3.8); 4.020 (3.7); 4.002 (2.4); 3.996 (1.8); 3.959 (1.0); 3.892 (3.0); 3.877 (0.4); 3.864 (3.6); 3.849 (3.9); 3.834 (0.4); 3.821 (3.3); 3.656 (0.4); 3.650 (0.4); 3.585 (3.2); 3.579 (6.6); 3.574 (3.3); 3.420 (0.7); 3.412 (1.2); 3.402 (0.9); 3.392 (1.4); 3.383 (2.4); 3.374 (1.5); 3.363 (1.0); 3.354 (1.5); 3.336 (16.3); 3.300 (1.0); 3.261 (4.3); 3.243 (4.3); 3.218 (3.1); 3.200 (3.5); 2.925 (0.7); 2.918 (0.8); 2.893 (1.8); 2.862 (1.8); 2.837 (0.7); 2.676 (0.4); 2.671 (0.6); 2.667 (0.5); 2.525 (1.8); 2.520 (2.9); 2.511 (38.2);

[0489]

2.507 (77.8); 2.502 (103.1); 2.498 (74.8); 2.493 (36.2); 2.333 (0.5); 2.329 (0.7); 2.324 (0.5); 2.149 (0.4); 2.094 (2.9); 2.072 (2.6); 1.989 (13.2); 1.799 (0.4); 1.791 (0.5); 1.768 (0.8); 1.760 (1.0); 1.738 (1.0); 1.729 (1.2); 1.697 (0.8); 1.691 (0.8); 1.579 (0.4); 1.553 (1.1); 1.523 (1.5); 1.501 (0.9); 1.493 (1.0); 1.472 (0.4); 1.397 (0.9); 1.299 (0.4); 1.259 (0.7); 1.249 (1.5); 1.235 (13.6); 1.220 (13.5); 1.208 (15.6); 1.198 (11.4); 1.193 (14.4); 1.183 (10.2); 1.175 (8.2); 1.157 (3.7); 0.008 (0.8); 0.000 (26.9); -0.009 (0.9)
实施例 I-33: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.052 (2.3); 8.048 (2.5); 7.515 (0.9); 7.511 (1.0); 7.494 (1.5); 7.472 (0.3); 7.468 (0.8); 7.464 (1.0); 7.453 (3.2); 7.448 (3.7); 7.434 (0.6); 7.423 (1.1); 7.417 (0.8); 7.405 (0.9); 7.398 (0.6); 7.389 (0.4); 7.383 (0.4); 6.006 (0.8); 5.986 (0.9); 5.978 (0.9); 5.960 (2.1); 5.935 (1.6); 4.354 (0.3); 4.220 (0.6); 4.216 (0.3); 4.212 (0.5); 4.203 (1.9); 4.198 (0.9); 4.193 (0.9); 4.185 (2.1); 4.181 (0.9); 4.176 (0.8); 4.167 (0.8); 4.038 (0.7); 4.020 (0.8); 4.002 (0.6); 3.993 (1.0); 3.964 (1.0); 3.949 (0.9); 3.921 (0.7); 3.552 (16.0); 3.395 (0.5); 3.359 (1.2); 3.339 (1.2); 3.326 (13.0); 3.315 (1.3); 3.296 (1.1); 3.284 (0.4); 2.902 (0.5); 2.871 (0.4); 2.565 (1.9); 2.524 (0.5); 2.520 (0.8); 2.511 (11.8); 2.506 (24.1); 2.502 (32.7); 2.497 (24.0); 2.493 (11.4); 2.107 (0.7); 2.101 (0.7); 1.989 (2.7); 1.909 (0.4); 1.541 (0.4); 1.532 (0.4); 1.225 (1.8); 1.221 (1.8); 1.207 (3.7); 1.203 (3.5); 1.193 (1.2); 1.189 (1.8); 1.185 (1.7); 1.175 (1.5); 1.157 (0.7); 0.008 (0.4); 0.000 (11.8); -0.009 (0.4)
实施例 I-34: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.049 (2.7); 8.046 (2.8); 7.584 (0.6); 7.579 (0.8); 7.564 (2.4); 7.559 (2.6); 7.556 (2.3); 7.536 (2.8); 7.516 (1.3); 7.488 (2.2); 7.483 (2.1); 7.469 (1.2); 7.464 (1.1); 6.188 (0.9); 6.160 (1.5); 6.130 (1.0); 5.965 (1.7); 5.939 (1.9); 5.756 (0.4); 4.359 (0.5); 4.222 (0.7); 4.213 (0.7); 4.204 (2.1); 4.199 (1.2); 4.195 (1.2); 4.186 (2.3); 4.182 (1.2); 4.178 (1.1); 4.168 (1.0); 4.038 (0.7); 4.020 (0.8); 4.002 (0.7); 3.975 (0.4); 3.856 (0.7); 3.825 (0.8); 3.813 (1.1); 3.782 (0.9); 3.586 (1.1); 3.559 (1.1); 3.543 (1.1); 3.528 (16.0); 3.516 (1.1); 3.437 (0.4); 3.407 (0.7); 3.378 (0.4); 3.322 (18.1); 3.290 (0.5); 3.262 (0.3); 3.246 (0.4); 2.910 (0.6); 2.879 (0.5); 2.565 (3.8); 2.524 (0.9); 2.511 (17.3); 2.506 (33.7); 2.502 (43.7); 2.497 (31.7); 2.493 (15.6); 2.124 (1.0); 2.095 (0.7); 1.989 (2.1); 1.740 (0.3); 1.580 (0.3); 1.549 (0.5); 1.520 (0.3); 1.397 (0.4); 1.225 (2.7); 1.208 (5.3); 1.190 (2.8); 1.175 (1.2); 1.157 (0.6); 0.008 (0.8); 0.000 (20.7); -0.008 (0.8)
实施例 I-35: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.316 (0.4); 7.977 (4.5); 7.967 (8.4); 7.432 (1.7); 7.411 (3.8); 7.394 (4.0); 7.373 (2.0); 7.009 (5.9); 6.988 (5.5); 6.907 (2.7); 6.882 (3.7);

[0490]

6.860 (2.6); 6.068 (2.3); 6.046 (3.0); 6.033 (3.8); 6.016 (2.7); 5.972 (3.4); 4.888 (0.5); 4.843 (12.8); 4.797 (1.7); 4.775 (1.9); 4.759 (1.7); 4.744 (1.2); 4.729 (0.7); 4.713 (0.3); 4.446 (0.6); 4.391 (1.4); 4.359 (1.5); 4.098 (0.7); 4.056 (1.7); 4.038 (4.1); 4.020 (3.9); 4.002 (1.9); 3.901 (0.5); 3.869 (0.6); 3.802 (1.6); 3.770 (1.8); 3.760 (2.3); 3.729 (2.0); 3.644 (0.7); 3.639 (0.7); 3.605 (1.3); 3.533 (7.5); 3.517 (3.3); 3.494 (3.2); 3.474 (2.3); 3.452 (2.4); 3.411 (1.6); 3.404 (1.6); 3.385 (1.4); 3.334 (69.6); 3.283 (1.5); 3.268 (1.5); 3.236 (1.2); 3.206 (0.9); 3.177 (0.5); 2.930 (0.6); 2.905 (1.2); 2.875 (1.3); 2.850 (0.6); 2.803 (0.4); 2.774 (0.7); 2.745 (0.4); 2.676 (0.9); 2.671 (1.2); 2.667 (0.9); 2.565 (14.7); 2.524 (3.0); 2.507 (148.5); 2.502 (193.1); 2.498 (143.4); 2.333 (1.0); 2.329 (1.3); 2.324 (1.1); 2.203 (0.3); 2.193 (0.3); 2.185 (0.5); 2.166 (0.5); 2.125 (2.3); 2.098 (2.9); 2.059 (1.3); 1.989 (15.1); 1.909 (2.6); 1.825 (0.4); 1.794 (0.7); 1.762 (0.9); 1.739 (1.1); 1.708 (1.0); 1.613 (0.8); 1.595 (1.6); 1.577 (2.3); 1.548 (3.5); 1.529 (4.6); 1.517 (5.8); 1.499 (6.5); 1.482 (4.9); 1.298 (2.4); 1.235 (8.3); 1.193 (8.4); 1.175 (10.4); 1.157 (5.1); 1.022 (0.4); 1.006 (0.4); 0.987 (0.3); 0.877 (3.3); 0.861 (9.4); 0.851 (10.6); 0.844 (10.5); 0.834 (16.0); 0.815 (10.1); 0.795 (3.3); 0.008 (1.2); 0.000 (30.0); -0.008 (1.2)

实施例 I-36: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.053 (2.5); 8.049 (2.5); 7.510 (1.2); 7.492 (1.9); 7.468 (1.1); 7.464 (1.2); 7.448 (4.3); 7.434 (0.8); 7.423 (1.3); 7.417 (1.0); 7.405 (1.1); 7.389 (0.5); 7.383 (0.8); 6.006 (2.5); 5.987 (1.3); 5.977 (2.4); 5.959 (1.0); 4.370 (0.6); 4.334 (0.7); 4.321 (0.7); 4.309 (0.6); 4.303 (0.6); 4.291 (1.0); 4.279 (1.0); 4.267 (0.4); 4.248 (0.5); 4.237 (1.0); 4.225 (1.0); 4.213 (0.5); 4.207 (0.6); 4.195 (0.5); 4.038 (0.9); 4.020 (0.8); 4.003 (0.9); 3.993 (1.1); 3.965 (1.1); 3.950 (1.0); 3.922 (0.9); 3.552 (16.0); 3.533 (3.1); 3.523 (3.8); 3.511 (1.1); 3.424 (0.4); 3.414 (0.4); 3.395 (0.7); 3.386 (0.7); 3.376 (0.5); 3.359 (1.5); 3.339 (1.7); 3.325 (22.7); 3.296 (1.3); 3.284 (0.7); 3.253 (6.4); 3.209 (5.6); 2.903 (0.6); 2.873 (0.6); 2.506 (36.1); 2.502 (46.0); 2.498 (35.1); 2.329 (0.3); 2.114 (1.0); 2.092 (1.0); 1.989 (2.2); 1.769 (0.3); 1.747 (0.4); 1.739 (0.4); 1.718 (0.4); 1.576 (0.4); 1.568 (0.4); 1.546 (0.5); 1.538 (0.5); 1.515 (0.4); 1.506 (0.3); 1.336 (0.3); 1.250 (0.4); 1.193 (0.6); 1.175 (1.2); 1.157 (0.6); 0.000 (0.4)

实施例 I-37: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.052 (2.3); 8.048 (2.3); 7.953 (0.5); 7.514 (0.9); 7.511 (1.0); 7.493 (1.6); 7.472 (0.3); 7.468 (0.8); 7.464 (1.0); 7.453 (3.2); 7.448 (3.7); 7.434 (0.6); 7.423 (1.2); 7.417 (0.8); 7.405 (0.9); 7.398 (0.6); 7.390 (0.4); 7.383 (0.4); 6.007 (0.8); 5.987 (0.9); 5.979 (0.9); 5.959 (0.8);

[0491]

5.929 (1.5); 5.891 (1.6); 4.987 (0.7); 4.971 (0.9); 4.956 (0.7); 4.377 (0.4); 4.345 (0.4); 4.038 (0.8); 4.020 (0.7); 4.002 (0.7); 3.992 (1.2); 3.964 (1.2); 3.948 (1.1); 3.920 (0.9); 3.552 (16.0); 3.423 (0.3); 3.403 (0.4); 3.395 (0.7); 3.385 (0.4); 3.375 (0.3); 3.365 (0.4); 3.357 (1.1); 3.337 (1.1); 3.325 (11.9); 3.314 (1.0); 3.294 (0.9); 3.274 (0.5); 3.239 (0.5); 2.891 (4.5); 2.867 (0.5); 2.732 (3.4); 2.565 (1.3); 2.524 (0.6); 2.511 (12.3); 2.507 (24.0); 2.502 (31.2); 2.498 (22.6); 2.493 (11.0); 2.102 (0.8); 2.082 (0.7); 1.989 (2.6); 1.528 (0.4); 1.236 (2.9); 1.231 (2.4); 1.226 (2.1); 1.221 (3.2); 1.215 (2.4); 1.209 (3.5); 1.198 (2.9); 1.193 (3.7); 1.183 (2.5); 1.175 (1.6); 1.157 (0.7); 0.008 (0.6); 0.000 (14.8); -0.008 (0.5)

实施例 I-38: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 7.971 (7.4); 7.965 (7.5); 7.432 (1.9); 7.415 (2.5); 7.411 (4.1); 7.394 (4.2); 7.390 (2.7); 7.373 (2.2); 7.009 (6.0); 6.988 (5.4); 6.908 (3.1); 6.887 (3.3); 6.883 (3.5); 6.861 (2.8); 6.069 (2.3); 6.046 (2.8); 6.038 (2.7); 6.016 (2.4); 5.933 (5.3); 5.895 (5.8); 5.006 (1.3); 4.990 (3.5); 4.974 (4.8); 4.959 (3.6); 4.943 (1.4); 4.889 (0.6); 4.883 (0.6); 4.849 (8.3); 4.843 (14.4); 4.838 (8.1); 4.804 (0.6); 4.798 (0.6); 4.382 (1.4); 4.354 (1.5); 4.056 (1.4); 4.038 (4.3); 4.020 (4.3); 4.002 (2.7); 3.972 (1.0); 3.805 (1.7); 3.803 (1.7); 3.775 (1.9); 3.772 (2.0); 3.763 (2.4); 3.760 (2.5); 3.730 (2.2); 3.540 (3.8); 3.534 (8.0); 3.528 (3.8); 3.496 (2.7); 3.475 (2.1); 3.453 (2.1); 3.440 (0.7); 3.431 (1.2); 3.421 (0.9); 3.411 (1.4); 3.402 (2.4); 3.393 (1.5); 3.383 (0.9); 3.374 (1.4); 3.365 (0.9); 3.338 (22.0); 3.314 (1.0); 3.283 (1.8); 3.249 (1.7); 3.220 (0.7); 2.933 (0.7); 2.909 (1.5); 2.878 (1.5); 2.854 (0.6); 2.676 (0.3); 2.671 (0.5); 2.667 (0.4); 2.565 (10.9); 2.524 (1.3); 2.511 (28.4); 2.507 (58.4); 2.502 (77.6); 2.497 (55.4); 2.493 (26.0); 2.333 (0.4); 2.329 (0.5); 2.324 (0.4); 2.122 (2.7); 2.099 (2.4); 1.989 (16.0); 1.909 (0.6); 1.825 (0.3); 1.815 (0.4); 1.784 (0.8); 1.762 (0.9); 1.755 (0.9); 1.735 (0.9); 1.706 (0.7); 1.607 (0.3); 1.576 (1.0); 1.554 (1.2); 1.546 (1.4); 1.523 (0.9); 1.515 (0.9); 1.494 (0.3); 1.237 (13.7); 1.221 (13.8); 1.210 (11.4); 1.204 (11.1); 1.193 (13.3); 1.189 (10.7); 1.175 (9.1); 1.157 (4.4); 0.146 (0.5); 0.008 (3.9); 0.000 (116.5); -0.009 (3.9); -0.150 (0.5)

实施例 I-39: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.056 (2.2); 8.049 (2.1); 7.507 (0.8); 7.488 (1.4); 7.472 (0.5); 7.467 (1.1); 7.463 (1.4); 7.452 (4.1); 7.448 (4.9); 7.433 (0.9); 7.421 (1.3); 7.415 (1.0); 7.403 (1.2); 7.387 (0.6); 7.381 (0.5); 6.027 (1.2); 6.007 (0.8); 5.986 (0.9); 5.980 (1.0); 5.966 (1.8); 5.756 (3.6); 4.782 (0.7); 4.769 (0.7); 4.384 (0.6); 4.351 (0.6); 4.056 (0.4); 4.038 (0.3); 4.020 (0.4); 3.991 (1.1); 3.963 (1.0); 3.947 (1.1); 3.919 (0.9); 3.550 (16.0);

[0492]

3.423 (0.3); 3.404 (0.6); 3.394 (0.6); 3.373 (0.5); 3.342 (10.9); 3.313 (0.8); 3.303 (0.9); 3.294 (0.8); 3.284 (0.8); 3.274 (0.6); 3.256 (0.5); 2.894 (0.6); 2.862 (0.5); 2.671 (0.4); 2.565 (8.3); 2.524 (0.7); 2.511 (23.2); 2.506 (47.9); 2.502 (64.8); 2.497 (48.9); 2.493 (24.6); 2.333 (0.4); 2.329 (0.5); 2.324 (0.4); 2.109 (0.9); 2.084 (1.0); 1.989 (0.7); 1.909 (0.6); 1.592 (0.5); 1.577 (0.7); 1.564 (0.8); 1.546 (1.1); 1.530 (1.3); 1.513 (1.9); 1.495 (1.7); 1.298 (0.8); 1.259 (1.8); 1.244 (1.9); 1.236 (1.9); 1.199 (1.5); 1.193 (1.6); 1.175 (1.4); 1.157 (0.8); 0.877 (1.2); 0.860 (3.2); 0.843 (2.7); 0.834 (2.7); 0.814 (2.3); 0.807 (2.3); 0.788 (1.5); 0.771 (0.4); 0.008 (1.2); 0.000 (35.3); -0.009 (1.2)

实施例 I-40: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 7.978 (0.4); 7.967 (8.0); 7.432 (0.8); 7.411 (1.8); 7.394 (1.8); 7.373 (0.9); 7.008 (2.8); 6.987 (2.5); 6.906 (1.4); 6.881 (1.7); 6.859 (1.3); 6.067 (1.2); 6.044 (1.5); 6.037 (1.5); 6.014 (1.3); 4.847 (3.9); 4.842 (6.3); 4.837 (3.9); 4.774 (0.5); 4.757 (1.1); 4.743 (1.5); 4.728 (1.1); 4.712 (0.4); 4.445 (1.0); 4.413 (1.0); 4.038 (0.4); 4.020 (0.4); 3.900 (0.9); 3.866 (1.0); 3.800 (0.8); 3.769 (1.0); 3.757 (1.2); 3.727 (1.1); 3.643 (1.2); 3.639 (1.1); 3.604 (2.2); 3.600 (2.2); 3.539 (2.1); 3.533 (4.8); 3.527 (3.9); 3.516 (1.7); 3.492 (2.3); 3.487 (1.8); 3.473 (1.4); 3.461 (0.4); 3.451 (1.1); 3.395 (0.6); 3.386 (0.8); 3.377 (0.5); 3.366 (0.8); 3.357 (1.3); 3.347 (1.1); 3.334 (1.2); 3.322 (16.8); 3.243 (2.0); 3.235 (0.8); 3.205 (1.3); 3.176 (0.7); 2.802 (0.6); 2.773 (1.2); 2.743 (0.7); 2.675 (0.4); 2.670 (0.5); 2.666 (0.4); 2.506 (63.1); 2.502 (82.5); 2.497 (61.5); 2.333 (0.5); 2.328 (0.6); 2.324 (0.5); 2.090 (1.6); 2.058 (1.8); 1.989 (1.6); 1.769 (0.3); 1.740 (0.8); 1.710 (0.7); 1.594 (0.4); 1.576 (0.9); 1.559 (1.4); 1.546 (1.7); 1.540 (2.0); 1.528 (1.6); 1.518 (2.1); 1.508 (2.1); 1.499 (3.5); 1.481 (3.6); 1.464 (2.0); 1.446 (0.8); 1.428 (0.3); 1.398 (0.5); 1.233 (4.7); 1.219 (4.3); 1.193 (1.8); 1.175 (1.4); 1.157 (0.7); 0.875 (0.5); 0.850 (7.6); 0.833 (16.0); 0.815 (6.6); 0.008 (2.0); 0.000 (44.5); -0.008 (2.0)

实施例 I-41: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.002 (9.7); 7.989 (0.3); 7.345 (0.9); 7.341 (1.2); 7.320 (4.5); 7.302 (3.9); 7.149 (3.1); 7.129 (2.6); 7.016 (1.7); 6.999 (3.0); 6.980 (1.4); 5.882 (1.5); 5.864 (1.7); 5.854 (1.7); 5.836 (1.5); 5.758 (3.5); 4.879 (8.1); 4.873 (8.1); 4.428 (1.0); 4.394 (1.1); 4.120 (2.3); 4.102 (7.3); 4.084 (7.4); 4.075 (0.5); 4.067 (2.4); 4.056 (0.5); 4.038 (1.1); 4.020 (1.1); 4.002 (0.4); 3.892 (1.6); 3.864 (2.3); 3.849 (2.9); 3.821 (2.8); 3.606 (0.9); 3.587 (2.1); 3.581 (4.4); 3.575 (2.4); 3.567 (6.5); 3.553 (6.3); 3.513 (0.9); 3.372 (0.4); 3.362 (0.7); 3.353 (0.6); 3.343 (0.9); 3.333 (2.2); 3.325 (22.4); 3.305 (0.9); 3.296 (0.5); 3.261 (2.0); 3.244 (2.0); 3.218 (2.4); 3.201 (1.9); 3.184 (1.5); 3.155 (0.8); 3.150 (0.7);

[0493]

2.793 (0.8); 2.766 (1.4); 2.762 (1.4); 2.736 (0.8); 2.730 (0.7); 2.524 (0.8); 2.511 (15.6); 2.507 (30.6); 2.502 (39.8); 2.498 (29.4); 2.493 (14.8); 2.065 (1.8); 2.034 (2.1); 1.989 (4.8); 1.741 (0.4); 1.720 (0.8); 1.711 (0.9); 1.689 (0.8); 1.680 (0.8); 1.659 (0.3); 1.562 (0.3); 1.552 (0.4); 1.531 (0.8); 1.521 (0.9); 1.500 (0.9); 1.491 (0.8); 1.470 (0.4); 1.249 (0.3); 1.210 (7.4); 1.192 (16.0); 1.183 (1.0); 1.174 (9.4); 1.157 (1.4); 0.000 (2.8)
<p>实施例 I-42: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 7.963 (9.3); 7.432 (0.9); 7.415 (1.1); 7.411 (1.9); 7.395 (1.9); 7.391 (1.2); 7.374 (1.0); 7.009 (2.8); 6.988 (2.6); 6.909 (1.4); 6.887 (1.6); 6.884 (1.7); 6.862 (1.3); 6.067 (1.2); 6.045 (1.5); 6.036 (1.4); 6.014 (1.3); 4.849 (3.8); 4.843 (6.7); 4.838 (3.8); 4.436 (0.9); 4.403 (0.9); 4.123 (2.2); 4.105 (6.9); 4.087 (7.0); 4.070 (2.3); 4.056 (0.7); 4.038 (2.0); 4.020 (2.1); 4.002 (0.7); 3.866 (0.9); 3.831 (0.9); 3.805 (0.9); 3.774 (0.9); 3.762 (1.2); 3.760 (1.2); 3.731 (1.1); 3.610 (0.7); 3.571 (5.9); 3.559 (5.8); 3.541 (2.0); 3.535 (4.1); 3.529 (1.9); 3.518 (2.0); 3.495 (1.4); 3.475 (1.1); 3.452 (1.1); 3.392 (0.4); 3.382 (0.7); 3.373 (0.4); 3.363 (0.8); 3.353 (1.4); 3.344 (0.9); 3.322 (48.8); 3.235 (0.6); 3.229 (0.7); 3.199 (1.3); 3.170 (0.7); 3.164 (0.6); 2.810 (0.7); 2.779 (1.2); 2.753 (0.7); 2.747 (0.6); 2.675 (0.5); 2.671 (0.6); 2.666 (0.5); 2.524 (1.7); 2.519 (2.8); 2.511 (35.9); 2.506 (71.7); 2.502 (93.8); 2.497 (67.9); 2.493 (32.9); 2.333 (0.5); 2.328 (0.6); 2.324 (0.5); 2.089 (1.6); 2.063 (1.8); 1.989 (8.7); 1.733 (0.7); 1.703 (0.6); 1.555 (0.7); 1.545 (0.7); 1.524 (0.7); 1.514 (0.6); 1.213 (7.5); 1.195 (16.0); 1.177 (8.3); 1.175 (6.3); 1.157 (2.4); 0.008 (2.5); 0.000 (72.0); -0.008 (2.5)</p>
<p>实施例 I-43: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 8.021 (0.4); 7.963 (3.6); 7.432 (0.5); 7.411 (1.0); 7.394 (1.1); 7.390 (0.8); 7.373 (0.6); 7.009 (1.6); 6.987 (1.4); 6.909 (0.8); 6.883 (1.0); 6.862 (0.8); 6.067 (0.6); 6.045 (0.8); 6.037 (0.8); 6.014 (0.7); 4.848 (2.1); 4.843 (3.6); 4.838 (2.3); 4.672 (0.3); 4.657 (0.7); 4.642 (0.5); 4.492 (0.4); 4.478 (0.9); 4.465 (0.5); 4.454 (0.3); 4.441 (0.9); 4.427 (0.5); 4.405 (0.4); 4.370 (0.4); 4.181 (1.3); 4.170 (1.6); 4.166 (1.2); 4.158 (1.5); 3.867 (0.4); 3.832 (0.4); 3.803 (0.6); 3.773 (0.6); 3.760 (0.8); 3.750 (0.4); 3.731 (0.7); 3.698 (0.5); 3.686 (0.8); 3.670 (0.9); 3.658 (1.3); 3.647 (1.0); 3.634 (0.7); 3.625 (0.6); 3.623 (0.6); 3.608 (2.0); 3.587 (2.0); 3.571 (1.2); 3.558 (1.0); 3.541 (1.7); 3.535 (2.8); 3.532 (2.9); 3.520 (2.5); 3.509 (1.9); 3.502 (0.8); 3.496 (1.2); 3.488 (1.0); 3.483 (0.7); 3.475 (1.3); 3.454 (2.8); 3.442 (3.2); 3.430 (1.6); 3.418 (0.4); 3.408 (0.4); 3.396 (1.8); 3.389 (1.3); 3.382 (1.9); 3.369 (0.5); 3.360 (1.3); 3.346 (1.9); 3.334 (1.3); 3.331 (1.6); 3.323 (10.2);</p>

[0494]

3.292 (0.3); 3.285 (0.3); 3.263 (1.9); 3.256 (1.4); 3.245 (16.0); 3.237 (11.2); 3.213 (0.6); 3.206 (0.8); 3.200 (0.8); 3.173 (0.4); 3.159 (0.3); 2.780 (0.5); 2.510 (13.8); 2.506 (26.5); 2.502 (34.4); 2.497 (25.4); 2.095 (0.7); 2.064 (0.8); 2.025 (0.7); 1.989 (1.2); 1.551 (0.4); 1.531 (0.4); 1.522 (0.4); 1.175 (0.6); 0.008 (0.8); 0.000 (18.9); -0.009 (0.9)
实施例 I-44: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 7.963 (7.1); 7.432 (0.6); 7.415 (0.8); 7.411 (1.3); 7.394 (1.3); 7.390 (0.8); 7.373 (0.7); 7.009 (1.8); 6.988 (1.7); 6.909 (0.9); 6.887 (1.0); 6.884 (1.1); 6.862 (0.9); 6.067 (0.8); 6.045 (1.0); 6.037 (0.9); 6.014 (0.8); 4.949 (0.5); 4.933 (1.4); 4.918 (1.9); 4.902 (1.4); 4.886 (0.6); 4.849 (2.6); 4.843 (4.5); 4.838 (2.5); 4.440 (0.6); 4.406 (0.6); 4.056 (0.4); 4.038 (1.2); 4.020 (1.2); 4.002 (0.4); 3.860 (0.5); 3.824 (0.6); 3.804 (0.6); 3.773 (0.6); 3.770 (0.6); 3.761 (0.8); 3.758 (0.8); 3.729 (0.7); 3.577 (0.8); 3.538 (4.2); 3.534 (3.9); 3.528 (1.7); 3.515 (3.9); 3.495 (1.0); 3.475 (1.4); 3.452 (0.7); 3.382 (0.4); 3.363 (0.5); 3.353 (0.9); 3.344 (0.6); 3.323 (16.4); 3.232 (0.4); 3.226 (0.5); 3.196 (0.8); 3.167 (0.4); 2.805 (0.4); 2.775 (0.8); 2.748 (0.4); 2.742 (0.4); 2.524 (0.8); 2.519 (1.2); 2.511 (14.2); 2.506 (28.6); 2.502 (37.7); 2.497 (26.9); 2.493 (12.8); 2.088 (1.0); 2.062 (1.1); 1.989 (5.2); 1.738 (0.5); 1.708 (0.4); 1.551 (0.4); 1.542 (0.4); 1.522 (0.4); 1.513 (0.4); 1.204 (16.0); 1.189 (15.9); 1.175 (3.0); 1.157 (1.4); 0.000 (7.3)
实施例 I-45: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.048 (5.6); 7.512 (0.8); 7.508 (0.9); 7.490 (1.3); 7.467 (0.9); 7.463 (1.0); 7.452 (2.9); 7.448 (3.7); 7.434 (0.6); 7.422 (1.1); 7.415 (0.8); 7.405 (0.7); 7.403 (0.8); 7.400 (0.7); 7.396 (0.6); 7.388 (0.4); 7.381 (0.4); 6.008 (0.8); 5.988 (0.9); 5.980 (0.9); 5.960 (0.8); 4.754 (0.5); 4.740 (0.7); 4.724 (0.4); 4.441 (0.4); 4.409 (0.4); 4.038 (0.7); 4.020 (0.7); 3.991 (0.7); 3.963 (0.8); 3.948 (0.9); 3.920 (0.8); 3.893 (0.4); 3.858 (0.4); 3.645 (0.4); 3.640 (0.5); 3.606 (0.7); 3.601 (1.0); 3.551 (16.0); 3.526 (0.7); 3.521 (1.1); 3.487 (0.4); 3.482 (0.6); 3.478 (0.4); 3.358 (0.4); 3.352 (1.3); 3.340 (0.5); 3.333 (1.2); 3.323 (15.6); 3.309 (1.0); 3.289 (0.9); 3.225 (0.4); 3.195 (0.6); 3.167 (0.3); 2.761 (0.5); 2.525 (0.4); 2.520 (0.7); 2.511 (8.9); 2.507 (18.1); 2.502 (24.1); 2.498 (17.5); 2.493 (8.3); 2.072 (0.7); 2.039 (0.7); 1.989 (3.1); 1.732 (0.3); 1.724 (0.3); 1.701 (0.3); 1.560 (0.5); 1.556 (0.6); 1.544 (0.6); 1.537 (0.7); 1.525 (0.8); 1.514 (0.9); 1.496 (1.6); 1.478 (1.4); 1.461 (0.9); 1.299 (0.4); 1.290 (0.3); 1.259 (0.8); 1.249 (1.1); 1.232 (1.7); 1.224 (1.7); 1.219 (1.7); 1.215 (1.6); 1.193 (1.7); 1.175 (2.0); 1.157 (0.9); 0.847 (2.8); 0.842 (1.6); 0.829 (6.4); 0.825 (3.4); 0.811 (2.8); 0.000 (7.8)

[0495]

实施例 I-46: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ = 8.045 (4.9); 7.514 (0.8); 7.510 (0.9); 7.492 (1.4); 7.472 (0.3); 7.468 (0.8); 7.463 (1.0); 7.452 (3.0); 7.448 (3.6); 7.433 (0.6); 7.423 (1.1);
 7.417 (0.8); 7.404 (0.9); 7.398 (0.6); 7.389 (0.4); 7.382 (0.4); 6.005 (0.8); 5.986 (0.9); 5.977 (0.9); 5.958 (0.8); 4.429 (0.5); 4.397 (0.5);
 4.178 (1.9); 4.170 (1.5); 4.167 (2.0); 4.163 (1.5); 4.155 (2.1); 4.038 (0.6); 4.020 (0.6); 3.992 (0.8); 3.964 (0.9); 3.949 (1.0); 3.921 (0.9);
 3.857 (0.4); 3.822 (0.5); 3.644 (0.6); 3.631 (0.6); 3.604 (2.6); 3.583 (2.6); 3.570 (0.3); 3.552 (15.0); 3.544 (1.0); 3.529 (2.3); 3.520 (1.5);
 3.517 (2.3); 3.506 (2.0); 3.454 (0.3); 3.442 (0.4); 3.370 (0.4); 3.356 (1.1); 3.351 (0.6); 3.337 (1.3); 3.331 (0.9); 3.322 (14.9); 3.313 (1.4);
 3.303 (0.4); 3.294 (0.9); 3.258 (0.7); 3.245 (2.2); 3.234 (16.0); 3.220 (0.5); 3.190 (0.7); 3.161 (0.4); 3.156 (0.3); 2.799 (0.4); 2.772 (0.6);
 2.768 (0.6); 2.742 (0.4); 2.524 (0.6); 2.511 (12.6); 2.506 (25.2); 2.502 (33.5); 2.497 (24.7); 2.493 (12.1); 2.075 (0.7); 2.043 (0.9); 1.989
 (2.5); 1.737 (0.4); 1.728 (0.4); 1.706 (0.4); 1.697 (0.4); 1.543 (0.4); 1.534 (0.4); 1.512 (0.4); 1.503 (0.4); 1.193 (0.7); 1.175 (1.3); 1.157
 (0.6); 0.000 (0.4)

实施例 I-47: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ = 8.030 (5.7); 7.590 (0.5); 7.574 (0.7); 7.569 (1.2); 7.553 (1.2); 7.548 (0.9); 7.532 (0.7); 7.347 (0.9); 7.329 (2.7); 7.308 (1.9); 7.302 (1.0);
 6.045 (0.7); 6.022 (1.0); 6.016 (0.9); 5.992 (0.8); 4.948 (0.5); 4.932 (1.2); 4.917 (1.6); 4.901 (1.2); 4.885 (0.5); 4.439 (0.6); 4.405 (0.7);
 4.038 (0.8); 4.020 (0.9); 3.898 (0.5); 3.894 (0.5); 3.863 (1.0); 3.855 (1.2); 3.850 (1.1); 3.824 (1.2); 3.578 (0.9); 3.557 (0.9); 3.546 (16.0);
 3.539 (3.9); 3.525 (1.2); 3.513 (3.2); 3.503 (1.1); 3.482 (0.8); 3.473 (0.9); 3.459 (0.7); 3.386 (0.4); 3.367 (0.6); 3.357 (0.9); 3.348 (0.5);
 3.338 (0.4); 3.323 (15.9); 3.224 (0.5); 3.194 (0.9); 3.166 (0.5); 2.803 (0.5); 2.771 (0.8); 2.745 (0.5); 2.740 (0.4); 2.524 (0.6); 2.511 (13.1);
 2.506 (26.6); 2.502 (35.3); 2.497 (26.5); 2.493 (13.5); 2.087 (1.1); 2.057 (1.2); 1.989 (3.7); 1.979 (0.6); 1.741 (0.5); 1.712 (0.5); 1.645 (0.7);
 1.544 (0.5); 1.514 (0.5); 1.203 (14.3); 1.187 (14.4); 1.175 (2.7); 1.169 (0.9); 1.157 (1.1); 0.000 (6.1)

实施例 I-48: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ = 8.034 (5.9); 7.968 (0.5); 7.590 (0.5); 7.574 (0.6); 7.569 (1.2); 7.553 (1.2); 7.548 (0.8); 7.532 (0.7); 7.346 (0.9); 7.329 (2.4); 7.322 (1.3);
 7.308 (1.8); 7.300 (0.9); 6.045 (0.7); 6.022 (0.9); 6.016 (0.9); 5.992 (0.7); 4.756 (0.6); 4.742 (0.9); 4.728 (0.6); 4.447 (0.6); 4.413 (0.6);
 4.056 (0.4); 4.038 (1.2); 4.020 (1.2); 4.002 (0.4); 3.896 (0.9); 3.865 (1.1); 3.853 (0.8); 3.848 (0.7); 3.818 (0.6); 3.643 (0.6); 3.604 (1.3);

[0496]

3.546 (16.0); 3.523 (2.0); 3.501 (1.0); 3.488 (1.0); 3.482 (1.2); 3.475 (0.8); 3.457 (0.7); 3.391 (0.4); 3.371 (0.5); 3.362 (0.8); 3.352 (0.5); 3.348 (0.7); 3.334 (1.0); 3.322 (15.3); 3.243 (2.3); 3.234 (0.5); 3.204 (0.8); 3.175 (0.4); 2.799 (0.4); 2.769 (0.7); 2.741 (0.4); 2.671 (0.3); 2.524 (0.9); 2.511 (20.6); 2.506 (41.4); 2.502 (54.7); 2.497 (39.9); 2.493 (19.7); 2.329 (0.4); 2.090 (0.9); 2.056 (1.1); 1.989 (5.2); 1.744 (0.5); 1.713 (0.4); 1.575 (0.5); 1.558 (0.8); 1.545 (0.9); 1.539 (1.2); 1.527 (1.0); 1.517 (1.2); 1.499 (2.1); 1.481 (2.1); 1.464 (1.2); 1.446 (0.4); 1.298 (0.6); 1.290 (0.7); 1.231 (2.6); 1.216 (2.5); 1.193 (2.3); 1.175 (3.1); 1.157 (1.5); 1.031 (0.4); 1.016 (0.4); 0.849 (4.4); 0.831 (9.4); 0.813 (4.0); 0.008 (1.2); 0.000 (33.5); -0.009 (1.3)

实施例 I-49: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.042 (6.1); 7.584 (0.6); 7.580 (0.9); 7.564 (2.6); 7.560 (2.7); 7.556 (2.3); 7.536 (2.9); 7.516 (1.4); 7.488 (2.3); 7.483 (2.1); 7.469 (1.3); 7.464 (1.1); 6.188 (1.0); 6.160 (1.6); 6.158 (1.5); 6.130 (1.1); 4.436 (0.6); 4.404 (0.7); 4.122 (1.5); 4.105 (4.6); 4.087 (4.7); 4.077 (0.3); 4.069 (1.6); 4.038 (0.6); 4.020 (0.6); 3.856 (1.3); 3.825 (1.6); 3.813 (1.4); 3.782 (1.1); 3.611 (0.6); 3.585 (1.3); 3.572 (4.0); 3.558 (5.0); 3.541 (1.8); 3.529 (16.0); 3.519 (1.1); 3.515 (1.3); 3.387 (0.5); 3.377 (0.3); 3.367 (0.6); 3.358 (1.0); 3.349 (0.6); 3.338 (0.5); 3.324 (14.5); 3.232 (0.4); 3.226 (0.5); 3.197 (0.9); 3.168 (0.5); 2.807 (0.5); 2.780 (0.9); 2.776 (0.9); 2.750 (0.5); 2.744 (0.4); 2.524 (0.6); 2.511 (11.9); 2.507 (22.8); 2.502 (29.4); 2.498 (21.5); 2.494 (10.6); 2.088 (1.2); 2.061 (1.3); 1.989 (2.4); 1.733 (0.5); 1.704 (0.5); 1.544 (0.5); 1.515 (0.5); 1.250 (0.3); 1.212 (5.0); 1.194 (10.3); 1.185 (0.8); 1.176 (5.4); 1.157 (0.7); 0.008 (0.4); 0.000 (8.1)

实施例 I-50: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.044 (5.0); 7.515 (0.8); 7.511 (0.9); 7.494 (1.4); 7.472 (0.3); 7.468 (0.8); 7.463 (0.9); 7.452 (2.9); 7.448 (3.4); 7.434 (0.6); 7.423 (1.1); 7.417 (0.7); 7.405 (0.8); 7.398 (0.6); 7.389 (0.4); 7.383 (0.3); 6.005 (0.8); 5.986 (0.9); 5.977 (0.9); 5.958 (0.8); 4.431 (0.5); 4.398 (0.5); 4.120 (1.2); 4.103 (3.6); 4.085 (3.6); 4.067 (1.2); 4.056 (0.5); 4.038 (1.3); 4.020 (1.3); 4.002 (0.5); 3.992 (0.8); 3.964 (0.9); 3.948 (1.0); 3.920 (0.9); 3.858 (0.5); 3.823 (0.5); 3.607 (0.4); 3.568 (3.2); 3.552 (16.0); 3.514 (0.5); 3.374 (0.4); 3.363 (0.3); 3.356 (1.3); 3.345 (0.9); 3.336 (1.5); 3.323 (20.2); 3.313 (1.3); 3.293 (0.9); 3.225 (0.3); 3.219 (0.4); 3.189 (0.7); 3.160 (0.4); 2.798 (0.4); 2.772 (0.6); 2.767 (0.6); 2.741 (0.4); 2.524 (0.7); 2.511 (11.9); 2.507 (23.2); 2.502 (30.3); 2.498 (22.1); 2.493 (10.8); 2.072 (0.8); 2.042 (0.9); 1.989 (5.6); 1.726 (0.4); 1.717 (0.4); 1.695 (0.4); 1.687 (0.4); 1.537 (0.4); 1.528 (0.4); 1.507 (0.4); 1.498 (0.4); 1.210 (3.8); 1.192 (9.0); 1.175 (6.4); 1.157

[0497]

(1.5); 0.000 (1.6)	
实施例 I-51: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):	
δ= 7.949 (9.4); 7.408 (1.9); 7.387 (3.8); 7.366 (2.8); 7.158 (3.4); 7.151 (3.9); 7.137 (2.8); 7.131 (3.3); 6.227 (1.5); 6.203 (2.0); 6.197 (1.8); 6.172 (1.6); 4.833 (0.4); 4.827 (0.4); 4.793 (3.5); 4.787 (4.5); 4.785 (4.5); 4.778 (3.4); 4.744 (0.4); 4.738 (0.4); 4.736 (0.9); 4.436 (0.9); 4.402 (1.0); 4.124 (2.3); 4.106 (7.1); 4.088 (7.3); 4.070 (2.4); 4.056 (0.7); 4.038 (2.0); 4.020 (2.0); 4.002 (0.7); 3.867 (0.9); 3.832 (1.0); 3.757 (1.2); 3.726 (1.5); 3.715 (2.1); 3.684 (1.7); 3.611 (0.8); 3.571 (6.9); 3.559 (6.2); 3.549 (2.3); 3.532 (1.4); 3.520 (0.9); 3.507 (1.3); 3.442 (1.9); 3.437 (4.2); 3.431 (2.0); 3.390 (0.4); 3.381 (0.7); 3.371 (0.5); 3.362 (0.8); 3.352 (1.4); 3.343 (0.9); 3.323 (22.6); 3.236 (0.7); 3.230 (0.8); 3.201 (1.3); 3.172 (0.8); 3.166 (0.6); 2.814 (0.7); 2.783 (1.3); 2.756 (0.7); 2.671 (0.3); 2.524 (0.9); 2.511 (19.4); 2.506 (38.8); 2.502 (51.0); 2.497 (37.8); 2.493 (18.9); 2.329 (0.4); 2.093 (1.7); 2.066 (1.9); 1.989 (8.4); 1.734 (0.8); 1.705 (0.7); 1.578 (0.3); 1.558 (0.7); 1.548 (0.8); 1.528 (0.7); 1.518 (0.7); 1.397 (0.5); 1.336 (0.4); 1.250 (0.5); 1.235 (0.3); 1.213 (7.7); 1.195 (16.0); 1.178 (8.1); 1.175 (6.6); 1.157 (2.3); 0.008 (0.5); 0.000 (14.3); -0.008 (0.5)	
实施例 I-52: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):	
δ= 8.002 (6.7); 7.345 (0.6); 7.341 (0.9); 7.320 (3.1); 7.301 (2.7); 7.149 (2.2); 7.129 (1.8); 7.016 (1.2); 6.998 (2.1); 6.979 (1.0); 5.882 (1.1); 5.864 (1.2); 5.854 (1.2); 5.836 (1.1); 4.945 (0.5); 4.929 (1.4); 4.914 (1.9); 4.898 (1.4); 4.879 (5.6); 4.873 (5.6); 4.430 (0.7); 4.397 (0.7); 4.056 (0.4); 4.038 (1.3); 4.020 (1.3); 4.003 (0.5); 3.891 (1.1); 3.863 (1.4); 3.848 (2.1); 3.820 (1.7); 3.587 (1.5); 3.581 (3.0); 3.575 (2.2); 3.535 (3.8); 3.506 (3.7); 3.467 (1.0); 3.362 (0.5); 3.353 (0.3); 3.343 (0.6); 3.333 (1.2); 3.324 (10.5); 3.305 (0.6); 3.260 (1.4); 3.242 (1.3); 3.217 (1.7); 3.199 (1.3); 3.181 (1.0); 3.152 (0.5); 2.787 (0.5); 2.761 (0.9); 2.756 (0.9); 2.730 (0.5); 2.724 (0.4); 2.524 (0.5); 2.511 (10.0); 2.507 (20.1); 2.502 (26.5); 2.498 (19.6); 2.493 (9.8); 2.062 (1.2); 2.032 (1.4); 1.989 (5.6); 1.726 (0.5); 1.717 (0.6); 1.695 (0.5); 1.687 (0.5); 1.528 (0.6); 1.518 (0.6); 1.496 (0.6); 1.487 (0.5); 1.397 (0.6); 1.200 (16.0); 1.193 (3.0); 1.185 (15.9); 1.175 (3.5); 1.157 (1.6); 0.000 (6.7)	
实施例 I-53: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):	
δ= 10.177 (9.2); 8.031 (2.9); 8.012 (3.2); 8.002 (10.5); 7.735 (1.1); 7.732 (1.1); 7.716 (2.8); 7.697 (2.0); 7.694 (1.9); 7.624 (2.1); 7.606 (7.2); 7.587 (4.1); 6.438 (1.6); 6.422 (1.8); 6.410 (1.8); 6.394 (1.6); 5.758 (1.9); 4.418 (1.1); 4.385 (1.2); 4.117 (2.6); 4.099 (7.7); 4.081	

[0498]

(9.3); 4.064 (2.7); 4.054 (2.4); 4.038 (3.7); 4.020 (1.6); 4.011 (2.0); 4.003 (0.7); 3.847 (1.1); 3.812 (1.2); 3.601 (0.9); 3.561 (7.0); 3.549 (6.8); 3.509 (0.9); 3.359 (0.5); 3.350 (0.9); 3.339 (0.8); 3.323 (30.5); 3.302 (0.7); 3.292 (0.9); 3.283 (0.5); 3.213 (2.9); 3.197 (2.3); 3.177 (1.7); 3.169 (2.6); 3.153 (2.4); 2.787 (0.9); 2.760 (1.5); 2.755 (1.5); 2.730 (0.9); 2.724 (0.8); 2.676 (0.4); 2.671 (0.6); 2.667 (0.4); 2.511 (32.8); 2.507 (62.6); 2.502 (80.3); 2.498 (58.4); 2.493 (28.7); 2.333 (0.4); 2.329 (0.5); 2.324 (0.4); 2.052 (1.9); 2.022 (2.2); 1.989 (6.4); 1.738 (0.3); 1.732 (0.4); 1.709 (0.8); 1.703 (0.9); 1.679 (0.8); 1.551 (0.4); 1.541 (0.4); 1.520 (0.9); 1.511 (1.0); 1.489 (0.9); 1.479 (0.8); 1.458 (0.4); 1.206 (7.9); 1.188 (16.0); 1.175 (4.6); 1.170 (7.8); 1.157 (1.8); 0.000 (0.8)

实施例 I-54: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.031 (6.0); 7.590 (0.5); 7.574 (0.6); 7.569 (1.2); 7.553 (1.2); 7.548 (0.8); 7.532 (0.7); 7.348 (0.8); 7.329 (2.5); 7.324 (1.2); 7.309 (1.7); 7.302 (0.8); 6.046 (0.7); 6.023 (0.8); 6.016 (0.8); 5.993 (0.7); 4.437 (0.5); 4.403 (0.5); 4.123 (1.3); 4.105 (4.2); 4.087 (4.2); 4.069 (1.4); 4.038 (0.8); 4.020 (0.8); 3.899 (0.5); 3.895 (0.4); 3.868 (0.9); 3.865 (1.0); 3.856 (0.9); 3.852 (0.8); 3.826 (0.9); 3.822 (0.8); 3.611 (0.5); 3.572 (3.5); 3.558 (3.6); 3.547 (16.0); 3.527 (0.8); 3.519 (0.6); 3.504 (0.8); 3.483 (0.6); 3.460 (0.6); 3.387 (0.4); 3.368 (0.5); 3.358 (0.8); 3.348 (0.5); 3.338 (0.4); 3.323 (13.1); 3.233 (0.3); 3.227 (0.4); 3.198 (0.7); 3.169 (0.4); 3.164 (0.3); 2.808 (0.4); 2.781 (0.7); 2.777 (0.7); 2.751 (0.4); 2.745 (0.3); 2.524 (0.5); 2.511 (9.6); 2.506 (19.2); 2.502 (25.2); 2.497 (18.1); 2.493 (8.6); 2.088 (0.9); 2.059 (1.0); 1.989 (3.4); 1.735 (0.4); 1.706 (0.4); 1.552 (0.4); 1.546 (0.4); 1.543 (0.4); 1.518 (0.4); 1.212 (4.6); 1.194 (9.5); 1.176 (4.9); 1.157 (0.9); 0.008 (0.7); 0.000 (20.1); -0.009 (0.7)

实施例 I-55: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 10.177 (10.8); 8.033 (3.4); 8.023 (1.0); 8.014 (4.0); 8.007 (11.0); 7.733 (1.2); 7.730 (1.3); 7.715 (3.3); 7.696 (2.4); 7.692 (2.3); 7.624 (2.6); 7.606 (8.4); 7.587 (4.7); 6.439 (1.8); 6.423 (2.1); 6.411 (2.0); 6.395 (1.9); 4.765 (0.5); 4.749 (1.5); 4.735 (1.9); 4.719 (1.4); 4.704 (0.5); 4.429 (1.3); 4.397 (1.3); 4.082 (2.0); 4.054 (2.5); 4.039 (6.0); 4.021 (3.8); 4.010 (2.2); 4.003 (1.4); 3.886 (1.2); 3.852 (1.3); 3.647 (1.0); 3.640 (1.6); 3.634 (1.0); 3.629 (0.6); 3.608 (1.6); 3.601 (2.8); 3.596 (1.7); 3.515 (1.6); 3.508 (2.7); 3.501 (1.5); 3.476 (1.0); 3.469 (1.6); 3.462 (0.9); 3.364 (0.5); 3.354 (0.9); 3.345 (0.7); 3.334 (1.4); 3.324 (24.1); 3.306 (0.8); 3.297 (1.0); 3.287 (0.6); 3.214 (1.2); 3.205 (2.7); 3.189 (3.8); 3.161 (2.7); 3.145 (2.6); 2.778 (0.9); 2.749 (1.6); 2.720 (0.9); 2.677 (0.3); 2.672 (0.4); 2.668 (0.3); 2.546 (0.4); 2.525

[0499]

(1.4); 2.512 (26.4); 2.508 (51.5); 2.503 (66.4); 2.499 (47.6); 2.494 (22.8); 2.334 (0.4); 2.330 (0.5); 2.325 (0.4); 2.050 (2.0); 2.018 (2.2); 1.990 (16.0); 1.749 (0.5); 1.737 (0.5); 1.718 (1.1); 1.688 (1.0); 1.656 (0.4); 1.583 (0.5); 1.566 (0.9); 1.549 (1.6); 1.531 (2.0); 1.507 (2.9); 1.489 (4.3); 1.471 (5.2); 1.454 (3.3); 1.441 (1.5); 1.397 (0.5); 1.352 (0.5); 1.336 (0.6); 1.299 (1.1); 1.259 (2.4); 1.249 (2.9); 1.219 (5.2); 1.209 (5.4); 1.193 (8.3); 1.176 (10.4); 1.158 (5.0); 0.882 (0.5); 0.876 (0.5); 0.864 (1.2); 0.859 (1.4); 0.840 (7.8); 0.821 (14.5); 0.813 (7.6); 0.805 (6.3); 0.803 (6.3); 0.008 (1.4); 0.000 (36.4); -0.009 (1.3)

实施例 I-56: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 10.176 (5.6); 8.032 (2.0); 8.013 (2.3); 8.002 (6.5); 7.732 (0.8); 7.716 (1.8); 7.697 (1.3); 7.694 (1.3); 7.624 (1.4); 7.606 (4.8); 7.587 (2.7); 7.349 (0.5); 6.437 (1.1); 6.421 (1.2); 6.410 (1.2); 6.394 (1.1); 5.678 (0.4); 4.941 (0.5); 4.925 (1.3); 4.910 (1.8); 4.894 (1.3); 4.878 (0.5); 4.421 (0.9); 4.387 (1.0); 4.082 (1.2); 4.054 (1.7); 4.038 (3.2); 4.020 (1.9); 4.010 (1.3); 4.003 (0.8); 3.841 (1.0); 3.807 (0.9); 3.630 (1.5); 3.584 (0.8); 3.568 (1.0); 3.529 (3.9); 3.502 (3.8); 3.463 (1.0); 3.349 (0.8); 3.324 (41.5); 3.292 (0.7); 3.283 (0.4); 3.210 (1.9); 3.194 (1.6); 3.173 (1.3); 3.167 (1.9); 3.151 (1.5); 2.781 (0.7); 2.750 (1.2); 2.723 (0.6); 2.671 (0.4); 2.507 (50.3); 2.502 (63.6); 2.498 (49.0); 2.329 (0.4); 2.325 (0.3); 2.049 (1.6); 2.019 (1.7); 1.989 (7.5); 1.710 (0.7); 1.682 (0.7); 1.536 (0.4); 1.505 (0.7); 1.485 (0.7); 1.476 (0.6); 1.397 (0.4); 1.195 (16.0); 1.179 (15.6); 1.157 (2.5); 1.095 (1.3); 1.079 (1.3); 0.000 (3.8)

实施例 I-57: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.005 (9.6); 7.340 (1.8); 7.319 (4.3); 7.300 (3.7); 7.297 (4.3); 7.186 (0.3); 7.148 (4.4); 7.128 (3.7); 7.014 (2.4); 6.996 (4.1); 6.977 (2.0); 5.882 (1.9); 5.864 (2.3); 5.855 (2.2); 5.837 (2.0); 5.757 (0.4); 4.875 (10.0); 4.870 (10.0); 4.770 (0.5); 4.753 (1.4); 4.740 (1.9); 4.724 (1.4); 4.708 (0.5); 4.436 (1.3); 4.404 (1.4); 3.888 (2.9); 3.860 (3.2); 3.845 (2.9); 3.818 (2.0); 3.641 (1.5); 3.602 (2.8); 3.586 (2.9); 3.580 (5.0); 3.575 (2.7); 3.516 (2.7); 3.477 (1.5); 3.366 (1.0); 3.357 (0.8); 3.347 (1.3); 3.323 (40.9); 3.257 (2.3); 3.239 (2.4); 3.214 (2.4); 3.196 (3.2); 3.161 (1.0); 2.784 (0.9); 2.756 (1.7); 2.726 (1.0); 2.671 (0.9); 2.506 (98.0); 2.502 (122.7); 2.498 (90.8); 2.333 (0.7); 2.329 (0.9); 2.324 (0.7); 2.179 (0.4); 2.064 (2.1); 2.032 (2.4); 1.747 (0.5); 1.726 (1.1); 1.695 (1.1); 1.665 (0.5); 1.591 (0.6); 1.573 (0.9); 1.556 (1.7); 1.537 (1.9); 1.514 (3.0); 1.495 (4.6); 1.478 (4.9); 1.461 (3.1); 1.351 (1.6); 1.336 (2.6); 1.298 (2.0); 1.258 (4.2); 1.249 (6.1); 1.235 (10.6); 0.846 (7.8); 0.828 (16.0); 0.810 (7.3); 0.000 (23.9); -0.008 (1.2)

[0500]

实施例 I-58: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ = 8.045 (5.8); 7.515 (0.8); 7.511 (1.0); 7.494 (1.4); 7.473 (0.3); 7.468 (0.8); 7.464 (1.0); 7.453 (3.2); 7.449 (3.7); 7.434 (0.6); 7.424 (1.1);
 7.417 (0.8); 7.405 (0.8); 7.402 (0.6); 7.398 (0.6); 7.390 (0.4); 7.383 (0.4); 6.005 (0.8); 5.986 (1.0); 5.978 (0.9); 5.958 (0.8); 5.758 (0.4);
 4.945 (0.4); 4.929 (1.1); 4.914 (1.5); 4.898 (1.1); 4.882 (0.4); 4.433 (0.5); 4.400 (0.5); 4.038 (0.8); 4.020 (0.8); 3.991 (0.8); 3.963 (1.0);
 3.948 (1.1); 3.920 (0.9); 3.851 (0.5); 3.816 (0.5); 3.575 (0.8); 3.553 (16.0); 3.536 (2.9); 3.509 (2.8); 3.470 (0.7); 3.375 (0.4); 3.355 (1.4);
 3.345 (0.9); 3.336 (1.7); 3.325 (20.3); 3.312 (1.2); 3.293 (1.0); 3.221 (0.3); 3.215 (0.4); 3.185 (0.7); 3.157 (0.4); 2.792 (0.4); 2.766 (0.6);
 2.761 (0.6); 2.735 (0.4); 2.524 (0.5); 2.520 (0.7); 2.511 (9.9); 2.507 (19.9); 2.502 (26.3); 2.497 (18.9); 2.493 (9.0); 2.070 (0.8); 2.039 (0.9);
 1.989 (3.6); 1.731 (0.4); 1.722 (0.4); 1.700 (0.4); 1.691 (0.4); 1.533 (0.4); 1.523 (0.4); 1.502 (0.4); 1.493 (0.4); 1.200 (13.3); 1.193 (1.8);
 1.185 (13.2); 1.175 (2.2); 1.157 (1.0); 0.008 (0.5); 0.000 (15.5); -0.009 (0.5)

实施例 I-59: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ = 7.953 (5.2); 7.930 (6.7); 7.417 (1.0); 7.407 (2.0); 7.386 (5.5); 7.370 (16.0); 7.361 (3.9); 7.356 (3.3); 7.349 (6.4); 7.344 (4.4); 7.334 (3.8);
 7.319 (1.0); 7.314 (1.4); 7.306 (1.1); 7.299 (0.8); 7.284 (1.7); 7.254 (1.4); 7.223 (1.1); 7.158 (3.9); 7.152 (4.3); 7.149 (4.5); 7.137 (3.3);
 7.133 (3.2); 7.129 (3.5); 7.088 (2.7); 7.080 (3.6); 7.067 (2.6); 6.952 (1.5); 6.944 (3.5); 6.906 (3.9); 6.230 (0.9); 6.219 (1.1); 6.206 (1.2);
 6.200 (1.2); 6.194 (1.6); 6.188 (1.4); 6.175 (0.9); 6.163 (1.1); 5.757 (0.5); 5.301 (1.4); 5.290 (0.9); 5.270 (3.7); 5.259 (3.1); 5.237 (6.2);
 5.205 (2.1); 4.826 (0.4); 4.793 (2.2); 4.785 (5.3); 4.779 (5.8); 4.771 (2.6); 4.738 (0.4); 4.458 (0.7); 4.426 (0.8); 4.397 (0.6); 4.363 (0.6);
 4.056 (0.5); 4.038 (1.5); 4.020 (1.5); 4.002 (0.5); 3.786 (0.5); 3.751 (1.4); 3.730 (1.3); 3.719 (0.9); 3.709 (1.6); 3.700 (1.6); 3.688 (1.6);
 3.678 (0.9); 3.657 (1.2); 3.567 (1.0); 3.549 (1.4); 3.542 (1.2); 3.524 (1.8); 3.506 (0.9); 3.500 (0.8); 3.482 (0.9); 3.446 (1.2); 3.440 (2.4);
 3.434 (1.2); 3.420 (1.3); 3.416 (2.5); 3.410 (1.3); 3.329 (36.5); 3.312 (1.1); 3.294 (0.7); 3.282 (0.6); 3.252 (0.5); 3.221 (0.9); 3.191 (0.5);
 2.983 (0.4); 2.953 (0.7); 2.933 (0.8); 2.926 (0.9); 2.902 (1.3); 2.876 (0.6); 2.870 (0.7); 2.671 (0.4); 2.524 (1.2); 2.511 (24.6); 2.506 (49.8);
 2.502 (65.0); 2.497 (47.0); 2.493 (22.7); 2.329 (0.4); 2.126 (0.5); 2.095 (1.1); 2.062 (0.7); 1.989 (6.5); 1.933 (0.4); 1.904 (0.6); 1.856 (0.6);
 1.825 (0.7); 1.749 (0.5); 1.719 (0.4); 1.588 (0.4); 1.555 (0.5); 1.536 (0.4); 1.518 (0.6); 1.509 (0.6); 1.486 (0.5); 1.478 (0.5); 1.192 (1.7);
 1.175 (3.5); 1.157 (1.7); 0.904 (0.6); 0.872 (0.5); 0.008 (1.8); 0.000 (50.4); -0.009 (1.9)

[0501]

实施例 I-60: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ = 8.049 (3.7); 8.022 (4.4); 7.502 (1.3); 7.485 (2.1); 7.463 (1.7); 7.450 (6.2); 7.436 (0.9); 7.432 (0.9); 7.418 (1.8); 7.413 (1.9); 7.401 (1.9); 7.383 (2.8); 7.369 (11.9); 7.360 (3.4); 7.344 (4.5); 7.329 (2.7); 7.307 (1.1); 7.281 (1.7); 7.250 (1.1); 7.220 (0.8); 7.208 (0.5); 7.148 (0.8); 7.118 (0.7); 7.085 (1.9); 7.080 (1.8); 7.072 (3.7); 6.950 (1.0); 6.939 (2.9); 6.901 (3.2); 6.010 (0.7); 5.998 (1.0); 5.991 (0.9); 5.979 (1.4); 5.970 (1.1); 5.963 (0.8); 5.951 (0.9); 5.299 (1.2); 5.286 (0.7); 5.267 (3.0); 5.255 (2.3); 5.232 (5.1); 5.201 (1.9); 4.454 (0.6); 4.423 (0.7); 4.393 (0.5); 4.358 (0.5); 4.056 (0.6); 4.038 (1.9); 4.020 (1.9); 4.002 (0.7); 3.991 (0.6); 3.966 (1.0); 3.948 (0.9); 3.939 (1.0); 3.923 (1.3); 3.895 (0.9); 3.772 (0.5); 3.735 (0.9); 3.695 (0.7); 3.552 (12.8); 3.548 (16.0); 3.353 (1.0); 3.329 (38.3); 3.316 (2.3); 3.291 (2.0); 3.272 (1.3); 3.241 (0.5); 3.210 (0.8); 3.179 (0.4); 2.936 (0.6); 2.918 (0.7); 2.908 (0.7); 2.887 (1.1); 2.862 (0.5); 2.854 (0.5); 2.671 (0.4); 2.507 (48.7); 2.502 (63.7); 2.498 (47.5); 2.329 (0.4); 2.110 (0.4); 2.075 (0.9); 2.043 (0.6); 1.989 (8.0); 1.915 (0.4); 1.886 (0.5); 1.826 (0.6); 1.799 (0.6); 1.738 (0.4); 1.731 (0.4); 1.709 (0.3); 1.701 (0.3); 1.565 (0.4); 1.534 (0.5); 1.502 (0.6); 1.494 (0.6); 1.472 (0.5); 1.463 (0.5); 1.397 (0.4); 1.193 (2.1); 1.175 (4.2); 1.157 (2.1); 0.875 (0.5); 0.868 (0.5); 0.845 (0.5); 0.837 (0.5); 0.008 (1.7); 0.000 (41.6); -0.008 (2.0)

实施例 I-61: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ = 8.046 (3.0); 8.021 (3.9); 7.582 (0.8); 7.578 (0.7); 7.562 (3.0); 7.557 (3.1); 7.537 (2.0); 7.535 (2.2); 7.518 (0.9); 7.515 (1.1); 7.490 (1.3); 7.485 (2.5); 7.481 (1.5); 7.471 (0.8); 7.466 (1.4); 7.461 (0.8); 7.417 (0.6); 7.384 (1.7); 7.381 (1.5); 7.370 (9.4); 7.361 (2.4); 7.356 (1.9); 7.346 (3.7); 7.330 (2.3); 7.316 (0.6); 7.310 (0.9); 7.302 (0.8); 7.296 (0.6); 7.285 (1.3); 7.252 (0.9); 7.222 (0.6); 7.213 (0.5); 7.151 (0.6); 7.120 (0.5); 7.087 (1.4); 7.076 (2.8); 7.067 (1.7); 6.952 (0.8); 6.944 (2.3); 6.904 (2.4); 6.191 (0.5); 6.178 (0.7); 6.163 (0.9); 6.151 (1.2); 6.133 (0.6); 6.121 (0.7); 5.300 (0.9); 5.288 (0.6); 5.269 (2.3); 5.257 (1.9); 5.235 (4.3); 5.204 (1.5); 4.460 (0.4); 4.427 (0.5); 4.397 (0.4); 4.364 (0.4); 4.056 (1.2); 4.038 (3.8); 4.020 (3.8); 4.002 (1.3); 3.852 (0.4); 3.828 (0.5); 3.821 (0.6); 3.809 (0.7); 3.799 (0.6); 3.785 (1.0); 3.778 (0.9); 3.755 (0.9); 3.702 (0.5); 3.582 (0.6); 3.563 (0.8); 3.555 (0.7); 3.530 (8.5); 3.520 (9.9); 3.493 (0.6); 3.328 (24.0); 3.298 (0.5); 3.286 (0.4); 3.247 (0.3); 3.218 (0.6); 2.948 (0.5); 2.922 (0.5); 2.915 (0.5); 2.897 (0.7); 2.871 (0.4); 2.865 (0.4); 2.524 (0.7); 2.511 (17.2); 2.507 (34.5); 2.502 (45.1); 2.498 (32.8); 2.494 (16.3); 2.093 (0.7); 2.059 (0.5); 1.989 (16.0); 1.900 (0.4); 1.849 (0.4); 1.825 (0.4); 1.817 (0.4); 1.547 (0.3); 1.539 (0.3); 1.508 (0.4); 1.476 (0.4); 1.397 (0.9); 1.193 (4.3); 1.175 (8.6); 1.157 (4.2); 0.889 (0.4); 0.858 (0.4); 0.008 (0.4); 0.008 (2.0)

[0502]

(1.2); 0.000 (33.2); -0.008 (1.4).
实施例 I-62: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.006 (4.6); 7.979 (5.1); 7.413 (1.1); 7.403 (0.6); 7.382 (3.4); 7.369 (16.0); 7.359 (5.1); 7.341 (7.8); 7.322 (7.4); 7.302 (5.6); 7.293 (3.6); 7.280 (2.7); 7.268 (0.8); 7.250 (1.6); 7.220 (1.2); 7.210 (0.8); 7.148 (5.0); 7.128 (3.3); 7.117 (1.1); 7.099 (0.4); 7.084 (2.9); 7.068 (4.7); 7.014 (2.1); 6.995 (3.6); 6.976 (1.7); 6.964 (0.4); 6.949 (1.5); 6.939 (4.0); 6.922 (0.4); 6.898 (4.1); 5.886 (0.9); 5.875 (1.3); 5.869 (1.2); 5.858 (2.2); 5.848 (1.5); 5.842 (1.1); 5.830 (1.2); 5.298 (1.5); 5.286 (1.0); 5.267 (4.1); 5.255 (3.1); 5.232 (6.9); 5.201 (2.5); 5.074 (0.4); 5.071 (0.4); 4.873 (9.5); 4.452 (0.8); 4.419 (0.9); 4.389 (0.7); 4.356 (0.7); 4.056 (0.7); 4.038 (2.1); 4.020 (2.1); 4.002 (0.7); 3.890 (0.8); 3.866 (1.3); 3.847 (1.2); 3.839 (1.4); 3.823 (1.7); 3.796 (1.2); 3.769 (0.7); 3.732 (1.3); 3.692 (0.9); 3.581 (3.3); 3.574 (3.7); 3.330 (34.3); 3.302 (1.5); 3.291 (1.3); 3.274 (1.0); 3.259 (1.6); 3.241 (2.7); 3.222 (1.6); 3.215 (1.6); 3.198 (2.4); 3.179 (1.5); 2.963 (0.5); 2.933 (0.9); 2.914 (1.0); 2.904 (1.0); 2.883 (1.5); 2.857 (0.8); 2.849 (0.7); 2.672 (0.4); 2.506 (53.1); 2.502 (67.3); 2.329 (0.5); 2.103 (0.6); 2.070 (1.3); 2.038 (0.9); 1.989 (8.8); 1.907 (0.5); 1.876 (0.7); 1.825 (0.8); 1.793 (0.8); 1.725 (0.6); 1.702 (0.5); 1.559 (0.6); 1.528 (0.7); 1.493 (0.8); 1.461 (0.7); 1.397 (2.7); 1.193 (2.4); 1.175 (4.7); 1.157 (2.3); 0.870 (0.7); 0.846 (0.7); 0.008 (2.0); 0.000 (44.2); -0.009 (2.6)
实施例 I-63: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 7.958 (1.5); 7.930 (2.2); 7.407 (0.7); 7.399 (0.4); 7.387 (1.7); 7.366 (1.0); 7.265 (0.6); 7.254 (0.5); 7.215 (0.3); 7.207 (0.3); 7.158 (1.5); 7.150 (1.6); 7.136 (1.4); 7.130 (1.5); 7.080 (0.7); 7.072 (0.7); 7.048 (1.6); 6.944 (0.3); 6.936 (0.4); 6.662 (0.9); 6.619 (1.4); 6.219 (0.4); 6.206 (0.4); 6.199 (0.4); 6.194 (0.6); 6.189 (0.5); 6.164 (0.4); 4.786 (1.9); 4.779 (2.0); 4.056 (0.5); 4.038 (1.6); 4.020 (1.6); 4.002 (0.6); 3.755 (0.5); 3.746 (0.5); 3.732 (0.5); 3.724 (0.5); 3.714 (0.6); 3.701 (0.5); 3.689 (0.6); 3.683 (0.4); 3.659 (0.4); 3.549 (0.7); 3.530 (0.3); 3.525 (0.5); 3.507 (0.5); 3.440 (0.4); 3.435 (0.7); 3.429 (0.4); 3.416 (0.9); 3.330 (20.6); 3.236 (0.3); 2.924 (0.3); 2.899 (0.4); 2.507 (18.4); 2.502 (23.6); 2.498 (17.3); 2.100 (0.4); 1.989 (7.1); 1.834 (0.4); 1.827 (0.3); 1.425 (16.0); 1.419 (11.9); 1.397 (3.8); 1.193 (1.9); 1.175 (3.7); 1.157 (1.8); 0.000 (5.9)
实施例 I-64: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.051 (1.5); 8.021 (2.1); 7.581 (0.4); 7.579 (0.4); 7.562 (1.5); 7.558 (1.6); 7.535 (1.4); 7.515 (0.6); 7.485 (1.3); 7.466 (0.7); 7.264 (0.5);

[0503]

7.252 (0.4); 7.133 (0.4); 7.078 (0.7); 7.065 (0.6); 7.046 (1.5); 6.943 (0.3); 6.663 (0.9); 6.615 (1.4); 6.178 (0.4); 6.159 (0.5); 6.150 (0.7); 6.120 (0.4); 4.056 (0.4); 4.038 (1.1); 4.020 (1.1); 4.002 (0.4); 3.811 (0.3); 3.798 (0.3); 3.785 (0.5); 3.780 (0.5); 3.755 (0.5); 3.742 (0.4); 3.563 (0.5); 3.555 (0.4); 3.531 (4.3); 3.520 (5.5); 3.493 (0.3); 3.329 (20.1); 3.231 (0.4); 2.918 (0.4); 2.891 (0.6); 2.507 (21.6); 2.502 (28.5); 2.498 (21.1); 2.094 (0.3); 1.989 (4.8); 1.851 (0.4); 1.826 (0.4); 1.424 (16.0); 1.418 (12.1); 1.397 (1.1); 1.193 (1.2); 1.175 (2.5); 1.157 (1.2); 0.000 (6.6)
实施例 I-65: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.012 (1.5); 7.979 (1.6); 7.394 (0.3); 7.341 (0.5); 7.321 (1.1); 7.312 (0.9); 7.301 (0.9); 7.293 (0.9); 7.261 (0.6); 7.248 (0.4); 7.211 (0.3); 7.148 (1.2); 7.128 (1.3); 7.076 (0.7); 7.070 (0.6); 7.062 (0.5); 7.043 (1.8); 7.014 (0.6); 6.996 (1.0); 6.977 (0.5); 6.941 (0.3); 6.662 (0.9); 6.610 (1.3); 5.875 (0.4); 5.866 (0.3); 5.857 (0.7); 5.848 (0.4); 5.830 (0.4); 4.874 (3.1); 4.869 (2.2); 3.867 (0.4); 3.847 (0.3); 3.840 (0.4); 3.824 (0.5); 3.797 (0.4); 3.737 (0.4); 3.589 (0.4); 3.584 (0.9); 3.575 (1.1); 3.569 (0.5); 3.331 (28.3); 3.309 (0.5); 3.300 (0.3); 3.257 (0.5); 3.240 (0.7); 3.222 (0.7); 3.215 (0.5); 3.197 (0.7); 3.180 (0.5); 2.910 (0.4); 2.878 (0.5); 2.507 (21.9); 2.503 (28.1); 2.498 (20.5); 2.072 (0.4); 1.989 (1.2); 1.830 (0.4); 1.799 (0.4); 1.422 (16.0); 1.416 (11.6); 1.397 (1.3); 1.193 (0.3); 1.175 (0.7); 1.157 (0.3); 0.008 (0.6); 0.000 (15.0); -0.009 (0.6)
实施例 I-66: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.054 (1.4); 8.023 (1.9); 7.508 (0.7); 7.487 (1.0); 7.463 (0.8); 7.451 (2.8); 7.433 (0.4); 7.419 (0.8); 7.399 (0.9); 7.385 (0.5); 7.263 (0.6); 7.250 (0.5); 7.212 (0.3); 7.130 (0.4); 7.077 (0.7); 7.069 (0.6); 7.062 (0.6); 7.045 (1.9); 6.942 (0.3); 6.663 (1.0); 6.613 (1.4); 6.000 (0.4); 5.990 (0.4); 5.981 (0.8); 5.972 (0.5); 5.962 (0.3); 5.953 (0.4); 4.038 (0.6); 4.020 (0.6); 3.969 (0.5); 3.948 (0.4); 3.941 (0.5); 3.925 (0.6); 3.898 (0.4); 3.739 (0.5); 3.701 (0.3); 3.554 (5.3); 3.549 (6.7); 3.353 (0.6); 3.332 (16.7); 3.293 (0.8); 3.275 (0.5); 3.225 (0.4); 2.913 (0.4); 2.884 (0.6); 2.853 (0.3); 2.507 (17.1); 2.503 (20.8); 2.499 (15.5); 2.080 (0.4); 1.990 (2.7); 1.837 (0.4); 1.805 (0.4); 1.423 (16.0); 1.416 (11.9); 1.193 (0.7); 1.175 (1.4); 1.157 (0.7); 0.000 (10.4)
实施例 I-67: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.046 (5.0); 7.584 (0.6); 7.580 (0.8); 7.564 (2.2); 7.560 (2.4); 7.537 (2.3); 7.517 (1.0); 7.488 (1.8); 7.484 (1.7); 7.469 (1.0); 7.465 (0.9);

[0504]

7.393 (2.5); 7.382 (5.0); 7.359 (2.4); 7.339 (1.8); 7.319 (0.7); 7.304 (0.6); 7.287 (0.5); 6.187 (1.0); 6.159 (1.5); 6.129 (1.0); 6.072 (1.7); 6.038 (1.7); 5.275 (0.5); 5.243 (1.7); 5.236 (1.7); 5.223 (1.7); 5.217 (1.7); 5.186 (0.5); 4.376 (0.5); 4.347 (0.5); 4.055 (0.4); 4.038 (1.1); 4.020 (1.3); 4.002 (0.7); 3.990 (0.5); 3.966 (0.4); 3.852 (0.6); 3.821 (0.7); 3.808 (0.9); 3.777 (0.8); 3.582 (0.7); 3.568 (1.0); 3.554 (0.8); 3.528 (16.0); 3.513 (0.7); 3.400 (0.4); 3.390 (0.6); 3.382 (0.5); 3.372 (0.6); 3.331 (46.4); 3.297 (0.3); 3.265 (0.5); 3.229 (0.5); 2.902 (0.6); 2.872 (0.6); 2.511 (15.9); 2.507 (30.8); 2.502 (39.7); 2.498 (28.8); 2.113 (1.0); 2.085 (1.1); 1.989 (4.3); 1.536 (0.4); 1.505 (0.4); 1.193 (1.1); 1.175 (2.3); 1.157 (1.1); 0.008 (1.8); 0.000 (39.6); -0.008 (1.7)

实施例 I-68: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.049 (4.7); 7.510 (1.1); 7.492 (1.7); 7.468 (0.8); 7.464 (1.0); 7.452 (3.1); 7.448 (3.7); 7.434 (0.6); 7.422 (1.2); 7.416 (0.9); 7.403 (1.1); 7.392 (2.4); 7.381 (5.2); 7.360 (2.3); 7.339 (1.3); 7.322 (0.6); 7.306 (0.5); 7.288 (0.4); 6.067 (1.6); 6.036 (1.7); 6.007 (0.8); 5.987 (0.9); 5.979 (0.9); 5.960 (0.8); 5.758 (0.4); 5.274 (0.5); 5.242 (1.6); 5.236 (1.5); 5.222 (1.5); 5.215 (1.5); 5.184 (0.5); 4.370 (0.4); 4.343 (0.4); 4.038 (0.6); 4.020 (0.8); 4.002 (0.5); 3.990 (1.3); 3.962 (1.3); 3.947 (1.3); 3.919 (0.9); 3.568 (1.3); 3.552 (16.0); 3.389 (0.4); 3.379 (0.5); 3.370 (0.5); 3.357 (1.1); 3.330 (29.2); 3.313 (0.8); 3.293 (0.8); 3.259 (0.5); 3.220 (0.4); 2.896 (0.5); 2.866 (0.5); 2.525 (0.6); 2.511 (13.0); 2.507 (26.1); 2.502 (34.0); 2.498 (24.4); 2.494 (11.8); 2.098 (0.9); 2.068 (1.0); 1.989 (2.4); 1.528 (0.4); 1.498 (0.4); 1.193 (0.6); 1.175 (1.3); 1.157 (0.6); 0.008 (1.4); 0.000 (36.9); -0.009 (1.4)

实施例 I-69: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 7.952 (11.5); 7.408 (3.0); 7.383 (16.0); 7.367 (9.9); 7.362 (8.1); 7.343 (4.9); 7.325 (2.2); 7.309 (1.5); 7.291 (1.2); 7.276 (0.5); 7.158 (6.2); 7.151 (6.7); 7.137 (5.3); 7.131 (5.7); 6.226 (2.7); 6.202 (3.6); 6.196 (3.4); 6.171 (2.9); 6.073 (4.7); 6.040 (5.0); 5.757 (1.2); 5.276 (1.5); 5.244 (5.2); 5.239 (5.4); 5.226 (4.6); 5.218 (4.6); 5.194 (0.9); 5.186 (1.5); 4.832 (0.7); 4.827 (0.7); 4.792 (6.0); 4.785 (8.5); 4.778 (6.3); 4.743 (0.7); 4.738 (0.8); 4.375 (1.4); 4.347 (1.5); 4.037 (0.9); 4.020 (1.5); 4.002 (1.5); 3.993 (1.4); 3.969 (1.0); 3.755 (1.0); 3.748 (1.0); 3.724 (1.2); 3.713 (2.2); 3.706 (1.6); 3.682 (1.5); 3.675 (1.4); 3.568 (1.8); 3.564 (1.8); 3.544 (1.7); 3.539 (1.8); 3.527 (1.2); 3.522 (1.2); 3.502 (1.2); 3.497 (1.2); 3.446 (3.5); 3.440 (7.3); 3.435 (3.7); 3.414 (0.7); 3.395 (1.1); 3.385 (1.5); 3.377 (1.4); 3.368 (1.5); 3.358 (1.3); 3.330 (91.1); 3.307 (1.0); 3.269 (1.5); 3.231 (1.4); 3.200 (0.7); 2.936 (0.7); 2.909 (1.7); 2.879 (1.7); 2.852 (0.6); 2.675 (0.4); 2.671

[0505]

(0.6); 2.667 (0.4); 2.506 (75.4); 2.502 (99.6); 2.498 (75.3); 2.333 (0.5); 2.329 (0.7); 2.324 (0.6); 2.116 (2.9); 2.083 (3.4); 1.989 (2.8); 1.788 (0.4); 1.760 (0.8); 1.735 (0.7); 1.673 (0.3); 1.645 (0.7); 1.615 (0.7); 1.576 (0.7); 1.545 (1.4); 1.515 (1.3); 1.492 (0.5); 1.192 (0.8); 1.175 (1.5); 1.157 (0.8); 0.146 (0.4); 0.008 (3.4); 0.000 (94.9); -0.150 (0.5)

实施例 I-70: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.261 (0.6); 8.005 (13.5); 7.391 (8.3); 7.380 (16.0); 7.358 (7.4); 7.350 (4.5); 7.345 (4.4); 7.340 (5.7); 7.333 (4.4); 7.320 (10.6); 7.301 (9.1); 7.287 (1.3); 7.274 (1.3); 7.149 (5.8); 7.128 (4.9); 7.015 (3.4); 6.997 (5.7); 6.978 (2.6); 6.088 (0.3); 6.066 (5.2); 6.033 (5.5); 5.883 (2.7); 5.865 (3.1); 5.856 (3.1); 5.838 (2.8); 5.273 (1.7); 5.266 (1.0); 5.241 (5.3); 5.235 (5.3); 5.221 (5.3); 5.215 (5.3); 5.189 (1.1); 5.183 (1.7); 5.075 (0.3); 4.876 (13.5); 4.870 (13.7); 4.366 (1.4); 4.341 (1.5); 4.055 (0.9); 4.038 (2.5); 4.020 (3.1); 4.002 (1.7); 3.980 (1.5); 3.954 (1.1); 3.889 (2.4); 3.861 (2.7); 3.846 (2.9); 3.818 (2.6); 3.585 (3.9); 3.579 (7.9); 3.573 (3.8); 3.568 (2.4); 3.396 (0.7); 3.386 (0.8); 3.376 (1.3); 3.367 (1.8); 3.358 (1.7); 3.332 (81.2); 3.285 (0.9); 3.260 (3.7); 3.243 (3.5); 3.217 (3.7); 3.200 (2.6); 3.185 (0.7); 2.918 (0.8); 2.890 (2.2); 2.860 (1.8); 2.835 (0.7); 2.731 (0.4); 2.676 (0.4); 2.671 (0.6); 2.667 (0.4); 2.524 (1.7); 2.511 (34.7); 2.507 (69.0); 2.502 (90.6); 2.498 (66.2); 2.494 (32.7); 2.333 (0.5); 2.329 (0.6); 2.324 (0.5); 2.091 (2.9); 2.061 (3.3); 1.989 (10.5); 1.762 (0.4); 1.732 (0.8); 1.709 (0.7); 1.679 (0.4); 1.655 (0.3); 1.648 (0.4); 1.618 (0.8); 1.593 (0.8); 1.563 (0.6); 1.554 (0.8); 1.523 (1.5); 1.493 (1.4); 1.461 (0.5); 1.397 (1.5); 1.193 (2.7); 1.175 (5.4); 1.157 (2.7); 0.146 (0.5); 0.008 (4.2); 0.000 (104.6); -0.008 (4.4); -0.150 (0.5)

实施例 I-71: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 7.954 (3.5); 7.408 (1.1); 7.388 (2.3); 7.367 (1.6); 7.158 (2.1); 7.151 (2.5); 7.137 (1.7); 7.131 (2.1); 6.228 (0.9); 6.203 (1.2); 6.197 (1.1); 6.173 (0.9); 5.845 (1.5); 5.820 (1.5); 5.757 (0.5); 4.792 (1.9); 4.785 (2.8); 4.778 (1.9); 4.390 (0.5); 4.357 (0.6); 4.038 (0.5); 4.020 (0.5); 4.001 (0.5); 3.996 (0.5); 3.755 (0.6); 3.724 (0.7); 3.713 (1.0); 3.682 (0.8); 3.568 (4.0); 3.547 (1.1); 3.530 (0.7); 3.505 (0.7); 3.437 (2.1); 3.399 (0.7); 3.355 (8.1); 3.277 (0.5); 3.247 (0.5); 2.907 (0.5); 2.877 (0.5); 2.565 (3.0); 2.507 (22.4); 2.502 (29.0); 2.498 (21.0); 2.126 (0.9); 2.097 (0.8); 1.989 (1.4); 1.577 (0.3); 1.558 (0.4); 1.547 (0.4); 1.527 (0.3); 1.429 (16.0); 1.420 (15.5); 1.193 (0.4); 1.175 (0.7); 1.157 (0.4); 0.000 (3.1)

实施例 I-72: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

[0506]

δ = 8.047 (5.0); 7.585 (0.7); 7.580 (0.9); 7.565 (2.6); 7.560 (2.8); 7.556 (2.4); 7.537 (2.9); 7.517 (1.4); 7.488 (2.3); 7.483 (2.2); 7.469 (1.3); 7.464 (1.1); 6.188 (1.1); 6.160 (1.7); 6.130 (1.1); 5.848 (1.6); 5.818 (1.6); 5.757 (0.7); 4.390 (0.6); 4.358 (0.6); 4.056 (0.5); 4.038 (1.7); 4.020 (1.7); 4.002 (0.9); 3.853 (0.7); 3.823 (0.9); 3.810 (1.1); 3.779 (0.9); 3.582 (0.8); 3.568 (2.1); 3.555 (0.8); 3.530 (16.0); 3.514 (0.7); 3.448 (0.3); 3.438 (0.4); 3.431 (0.4); 3.411 (0.6); 3.404 (0.7); 3.375 (0.5); 3.347 (12.7); 3.274 (0.6); 3.244 (0.6); 2.901 (0.6); 2.870 (0.6); 2.566 (2.7); 2.507 (23.8); 2.503 (30.9); 2.498 (22.6); 2.149 (0.4); 2.122 (1.1); 2.092 (0.9); 1.989 (6.4); 1.721 (0.3); 1.551 (0.4); 1.539 (0.4); 1.520 (0.4); 1.509 (0.4); 1.485 (1.5); 1.429 (16.0); 1.417 (15.9); 1.193 (1.7); 1.175 (3.4); 1.157 (1.7); 0.000 (3.5)

实施例 I-73: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8.007 (4.1); 7.345 (0.6); 7.341 (0.8); 7.321 (2.1); 7.302 (1.8); 7.298 (1.8); 7.149 (2.0); 7.129 (1.7); 7.016 (1.1); 6.998 (1.9); 6.979 (0.9); 5.883 (1.0); 5.865 (1.1); 5.855 (1.3); 5.846 (1.8); 5.837 (1.2); 5.813 (1.7); 4.878 (4.9); 4.872 (4.8); 4.381 (0.6); 4.350 (0.7); 4.038 (0.4); 4.020 (0.6); 3.986 (0.6); 3.951 (0.3); 3.890 (0.7); 3.862 (0.7); 3.847 (0.8); 3.819 (0.7); 3.583 (1.9); 3.409 (0.4); 3.387 (0.7); 3.379 (0.7); 3.358 (0.4); 3.331 (21.5); 3.261 (1.1); 3.254 (0.9); 3.243 (0.8); 3.234 (1.0); 3.219 (0.6); 3.201 (0.7); 3.193 (0.6); 2.886 (0.6); 2.856 (0.6); 2.507 (21.5); 2.503 (27.2); 2.499 (19.8); 2.096 (1.1); 2.067 (1.0); 1.990 (1.3); 1.736 (0.3); 1.705 (0.3); 1.533 (0.5); 1.523 (0.4); 1.502 (0.4); 1.427 (16.0); 1.413 (12.4); 1.397 (2.8); 1.193 (0.4); 1.175 (0.7); 1.157 (0.3); 0.000 (14.1)

实施例 I-74: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8.050 (4.6); 7.511 (1.0); 7.492 (1.6); 7.468 (0.9); 7.464 (1.1); 7.453 (3.3); 7.449 (3.8); 7.435 (0.6); 7.424 (1.2); 7.417 (0.8); 7.405 (1.0); 7.398 (0.6); 7.390 (0.5); 7.383 (0.4); 6.007 (0.9); 5.988 (1.0); 5.979 (1.0); 5.960 (0.9); 5.845 (1.5); 5.815 (1.5); 4.385 (0.5); 4.354 (0.6); 4.038 (0.4); 4.020 (0.6); 4.002 (0.4); 3.990 (1.3); 3.962 (1.0); 3.947 (1.1); 3.919 (0.8); 3.553 (16.0); 3.398 (0.6); 3.392 (0.6); 3.357 (0.7); 3.351 (0.7); 3.331 (24.7); 3.314 (0.6); 3.307 (0.6); 3.294 (0.7); 3.267 (0.5); 3.235 (0.5); 2.891 (0.6); 2.861 (0.6); 2.507 (22.1); 2.503 (27.8); 2.499 (19.7); 2.103 (1.0); 2.074 (0.8); 1.990 (1.4); 1.538 (0.4); 1.529 (0.4); 1.507 (0.4); 1.427 (14.5); 1.412 (12.8); 1.397 (0.8); 1.193 (0.4); 1.175 (0.7); 1.157 (0.4); 0.008 (0.7); 0.000 (15.8); -0.008 (0.6)

实施例 I-75: $^1\text{H-NMR}$ (400.0 MHz, d_6 -DMSO):

δ = 8.043 (5.6); 7.511 (1.2); 7.494 (1.7); 7.467 (0.9); 7.463 (1.1); 7.452 (3.2); 7.448 (4.2); 7.434 (0.7); 7.422 (1.2); 7.416 (0.9); 7.404 (1.0);

[0507]

7.397 (0.8); 7.387 (1.2); 7.381 (1.1); 7.371 (6.5); 7.354 (3.5); 7.335 (1.2); 7.322 (0.8); 7.317 (1.1); 7.310 (0.8); 7.301 (1.0); 7.291 (0.3); 6.007 (0.9); 5.988 (1.1); 5.960 (1.0); 5.136 (8.9); 4.431 (0.6); 4.398 (0.7); 4.038 (0.7); 4.020 (0.8); 3.992 (0.9); 3.964 (1.0); 3.949 (1.2); 3.921 (1.0); 3.857 (0.6); 3.822 (0.7); 3.703 (0.7); 3.663 (3.3); 3.642 (3.2); 3.602 (0.7); 3.552 (16.0); 3.356 (1.3); 3.330 (30.5); 3.313 (1.6); 3.304 (0.5); 3.293 (1.4); 3.208 (0.4); 3.202 (0.5); 3.173 (0.9); 3.144 (0.5); 2.796 (0.5); 2.764 (0.8); 2.738 (0.5); 2.732 (0.4); 2.507 (19.3); 2.502 (25.1); 2.498 (18.2); 2.068 (0.6); 2.036 (1.1); 1.997 (0.7); 1.989 (3.5); 1.673 (0.5); 1.664 (0.6); 1.642 (0.5); 1.633 (0.5); 1.521 (0.5); 1.511 (0.6); 1.490 (0.5); 1.480 (0.5); 1.193 (0.8); 1.175 (1.6); 1.157 (0.8); 0.000 (0.5)

实施例 I-76: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.039 (6.0); 7.583 (0.6); 7.579 (0.9); 7.563 (2.4); 7.558 (2.7); 7.555 (2.4); 7.535 (2.7); 7.516 (1.3); 7.488 (2.1); 7.484 (2.0); 7.469 (1.1); 7.465 (1.0); 7.393 (0.5); 7.388 (1.0); 7.371 (6.6); 7.354 (3.8); 7.335 (1.3); 7.323 (0.9); 7.318 (1.2); 7.311 (0.8); 7.301 (1.0); 7.292 (0.3); 7.286 (0.3); 6.189 (1.0); 6.161 (1.5); 6.131 (1.0); 5.138 (8.9); 4.436 (0.7); 4.404 (0.7); 4.038 (0.7); 4.020 (0.7); 3.854 (1.2); 3.823 (1.5); 3.811 (1.3); 3.780 (1.0); 3.707 (0.8); 3.667 (3.2); 3.643 (3.1); 3.603 (0.8); 3.583 (1.1); 3.556 (1.1); 3.539 (1.2); 3.527 (16.0); 3.513 (1.0); 3.363 (0.5); 3.353 (0.4); 3.328 (26.2); 3.306 (0.6); 3.210 (0.5); 3.180 (0.9); 3.151 (0.5); 2.803 (0.5); 2.772 (0.9); 2.746 (0.5); 2.740 (0.4); 2.507 (19.4); 2.502 (25.1); 2.498 (18.5); 2.086 (0.6); 2.052 (1.1); 2.017 (0.7); 1.989 (2.8); 1.676 (0.5); 1.646 (0.5); 1.526 (0.5); 1.497 (0.5); 1.193 (0.7); 1.175 (1.4); 1.157 (0.7); 0.000 (0.6)

实施例 I-77: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):

δ= 8.000 (11.3); 7.390 (1.0); 7.385 (1.7); 7.369 (10.9); 7.352 (6.1); 7.345 (2.2); 7.340 (2.0); 7.333 (2.4); 7.320 (6.9); 7.301 (6.3); 7.282 (0.5); 7.148 (3.3); 7.128 (2.8); 7.015 (1.8); 6.997 (3.2); 6.979 (1.5); 5.883 (1.6); 5.865 (1.9); 5.855 (1.8); 5.837 (1.7); 5.134 (16.0); 4.876 (8.8); 4.870 (8.8); 4.427 (1.1); 4.393 (1.1); 4.056 (0.9); 4.038 (2.6); 4.020 (2.6); 4.002 (0.9); 3.890 (1.8); 3.862 (2.5); 3.847 (3.0); 3.819 (2.9); 3.699 (1.3); 3.660 (6.0); 3.639 (5.9); 3.600 (1.3); 3.585 (2.5); 3.579 (5.0); 3.574 (2.3); 3.349 (0.5); 3.339 (1.2); 3.325 (49.6); 3.311 (1.8); 3.302 (1.0); 3.292 (0.6); 3.282 (0.8); 3.273 (0.5); 3.260 (2.0); 3.242 (2.0); 3.217 (1.8); 3.199 (2.4); 3.167 (1.5); 3.138 (0.8); 2.791 (0.8); 2.764 (1.3); 2.759 (1.4); 2.734 (0.9); 2.727 (0.7); 2.676 (0.3); 2.671 (0.5); 2.667 (0.3); 2.524 (1.4); 2.511 (28.6); 2.506 (57.0); 2.502 (74.4); 2.497 (53.2); 2.493 (25.4); 2.333 (0.4); 2.329 (0.5); 2.324 (0.3); 2.064 (1.0); 2.029 (1.9); 1.989 (12.2); 1.697 (0.4); 1.686 (0.4); 1.665

[0508]

(0.9); 1.657 (1.0); 1.635 (0.9); 1.626 (0.9); 1.605 (0.4); 1.545 (0.4); 1.534 (0.4); 1.514 (0.9); 1.504 (1.0); 1.483 (0.9); 1.473 (0.9); 1.454 (0.4); 1.397 (0.9); 1.193 (3.1); 1.175 (6.1); 1.157 (3.0); 0.146 (0.3); 0.008 (3.2); 0.000 (80.6); -0.009 (3.1); -0.017 (0.4); -0.150 (0.4)
实施例 I-78: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 7.948 (11.4); 7.940 (0.5); 7.408 (2.4); 7.395 (1.0); 7.387 (5.5); 7.374 (11.8); 7.370 (8.1); 7.357 (6.8); 7.351 (1.7); 7.342 (1.5); 7.339 (2.1); 7.337 (2.1); 7.326 (1.4); 7.321 (2.1); 7.314 (1.4); 7.308 (1.7); 7.305 (1.7); 7.295 (0.6); 7.289 (0.6); 7.159 (3.9); 7.151 (4.7); 7.137 (3.1); 7.131 (3.9); 6.228 (1.8); 6.203 (2.3); 6.197 (2.1); 6.172 (1.8); 5.757 (3.2); 5.140 (16.0); 4.833 (0.5); 4.827 (0.5); 4.793 (4.0); 4.787 (5.3); 4.778 (4.0); 4.744 (0.5); 4.738 (0.5); 4.436 (1.0); 4.403 (1.1); 3.867 (1.0); 3.832 (1.1); 3.753 (1.2); 3.722 (1.4); 3.710 (2.4); 3.680 (1.9); 3.667 (5.9); 3.646 (5.8); 3.606 (1.3); 3.569 (2.1); 3.545 (2.1); 3.527 (1.4); 3.503 (1.5); 3.446 (2.3); 3.440 (5.0); 3.434 (2.2); 3.369 (0.4); 3.360 (0.8); 3.350 (0.6); 3.340 (1.1); 3.327 (28.5); 3.312 (0.7); 3.302 (0.8); 3.293 (0.4); 3.221 (0.7); 3.214 (0.9); 3.185 (1.4); 3.156 (0.8); 3.151 (0.7); 2.810 (0.8); 2.784 (1.3); 2.779 (1.4); 2.753 (0.8); 2.748 (0.7); 2.524 (0.7); 2.511 (17.2); 2.507 (34.9); 2.502 (45.5); 2.497 (32.3); 2.493 (15.3); 2.093 (0.9); 2.089 (0.9); 2.057 (1.8); 2.021 (1.1); 1.989 (1.1); 1.710 (0.3); 1.681 (0.8); 1.655 (0.8); 1.571 (0.3); 1.561 (0.4); 1.540 (0.8); 1.531 (0.9); 1.510 (0.9); 1.500 (0.8); 1.480 (0.3); 1.175 (0.6); 0.008 (1.6); 0.000 (46.9); -0.009 (1.6)
实施例 I-79: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.042 (1.9); 7.564 (0.9); 7.560 (1.0); 7.556 (0.8); 7.536 (1.0); 7.516 (0.5); 7.487 (0.8); 7.483 (0.7); 7.468 (0.5); 7.464 (0.4); 6.187 (0.4); 6.160 (0.6); 6.129 (0.4); 3.854 (0.4); 3.823 (0.5); 3.811 (0.7); 3.780 (0.4); 3.583 (0.4); 3.556 (0.5); 3.539 (0.5); 3.529 (5.3); 3.512 (0.4); 3.455 (1.5); 3.449 (1.4); 3.357 (0.4); 3.328 (5.2); 3.191 (0.3); 2.507 (8.6); 2.503 (10.7); 2.498 (7.7); 2.088 (0.4); 2.062 (0.5); 1.989 (1.1); 1.413 (16.0); 1.175 (0.6); 0.000 (7.4); -0.008 (0.4)
实施例 I-80: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 7.949 (2.2); 7.408 (0.5); 7.387 (0.9); 7.367 (0.7); 7.159 (0.8); 7.151 (1.0); 7.137 (0.7); 7.131 (0.8); 6.228 (0.4); 6.203 (0.5); 6.197 (0.4); 6.172 (0.4); 4.793 (0.8); 4.786 (1.2); 4.778 (0.8); 3.724 (0.3); 3.713 (0.5); 3.682 (0.4); 3.573 (0.4); 3.548 (0.4); 3.455 (1.7); 3.451 (1.7); 3.443 (0.6); 3.437 (1.1); 3.431 (0.5); 3.351 (0.3); 3.328 (4.4); 2.511 (3.0); 2.507 (5.9); 2.502 (7.6); 2.498 (5.5); 2.494 (2.7); 2.094 (0.4); 2.067 (0.5); 1.989 (0.9); 1.414 (16.0); 1.406 (1.3); 1.175 (0.5); 0.000 (5.9)

[0509]

<p>实施例 I-81: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 8.045 (2.1); 7.512 (0.5); 7.494 (0.7); 7.468 (0.4); 7.464 (0.4); 7.453 (1.4); 7.449 (1.7); 7.424 (0.5); 7.418 (0.4); 7.405 (0.4); 6.007 (0.4); 5.988 (0.4); 5.980 (0.4); 5.960 (0.4); 3.992 (0.4); 3.964 (0.4); 3.948 (0.5); 3.920 (0.4); 3.554 (6.2); 3.454 (1.5); 3.445 (1.5); 3.355 (0.6); 3.344 (0.5); 3.331 (5.3); 3.312 (0.5); 3.292 (0.4); 3.183 (0.4); 2.755 (0.4); 2.507 (6.6); 2.503 (8.2); 2.070 (0.5); 2.043 (0.6); 1.990 (1.2); 1.410 (16.0); 1.398 (1.0); 1.175 (0.6); 0.000 (2.0)</p>
<p>实施例 I-82: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 8.001 (2.3); 7.319 (0.8); 7.299 (0.8); 7.149 (0.7); 7.128 (0.6); 7.016 (0.4); 6.998 (0.7); 5.881 (0.3); 5.864 (0.4); 5.854 (0.4); 5.836 (0.3); 4.878 (1.8); 4.872 (1.8); 4.038 (0.5); 4.020 (0.5); 3.889 (0.4); 3.861 (0.4); 3.846 (0.5); 3.819 (0.5); 3.588 (0.5); 3.582 (1.1); 3.576 (0.5); 3.451 (1.4); 3.440 (1.4); 3.329 (10.1); 3.257 (0.4); 3.240 (0.4); 3.214 (0.5); 3.197 (0.4); 2.511 (5.6); 2.507 (10.9); 2.502 (14.1); 2.498 (10.0); 2.494 (4.8); 2.063 (0.4); 2.035 (0.5); 1.989 (2.3); 1.409 (16.0); 1.193 (0.6); 1.175 (1.2); 1.157 (0.6); 0.000 (3.9)</p>
<p>实施例 II-01: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 7.375 (1.3); 7.372 (1.3); 7.363 (5.7); 7.348 (0.7); 7.336 (0.4); 7.290 (0.6); 7.244 (0.6); 7.157 (1.6); 7.069 (0.7); 7.057 (0.8); 7.045 (0.7); 7.024 (2.2); 6.920 (0.4); 6.905 (1.4); 6.888 (0.8); 6.858 (1.0); 5.363 (3.5); 5.299 (0.3); 5.267 (0.9); 5.253 (0.9); 5.233 (0.9); 5.225 (0.9); 5.202 (0.3); 4.056 (1.2); 4.038 (3.7); 4.020 (3.7); 4.002 (1.2); 3.735 (0.4); 3.675 (0.4); 3.325 (15.5); 3.207 (0.3); 3.156 (0.4); 3.145 (0.5); 3.134 (0.4); 2.670 (0.8); 2.666 (0.7); 2.633 (0.4); 2.524 (0.4); 2.511 (8.6); 2.506 (17.6); 2.502 (23.2); 2.497 (16.6); 2.493 (8.0); 1.989 (16.0); 1.980 (0.4); 1.846 (0.4); 1.836 (0.3); 1.813 (0.4); 1.803 (0.4); 1.669 (0.3); 1.657 (0.5); 1.648 (0.4); 1.636 (0.4); 1.625 (0.4); 1.602 (0.4); 1.594 (0.4); 1.193 (4.2); 1.175 (8.4); 1.157 (4.1); 1.110 (0.4); 0.008 (0.8); 0.000 (22.3); -0.009 (0.8)</p>
<p>实施例 II-02: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):</p> <p>δ= 9.438 (0.5); 9.387 (0.5); 9.162 (0.5); 9.074 (0.5); 7.381 (0.5); 7.352 (0.4); 7.248 (0.6); 7.219 (0.7); 7.195 (0.5); 7.184 (0.5); 7.115 (0.4); 7.087 (0.4); 7.059 (1.1); 7.048 (1.0); 7.037 (1.2); 7.023 (1.1); 6.924 (0.5); 6.912 (0.5); 6.625 (1.6); 6.583 (1.7); 4.450 (0.6); 4.417 (0.6); 4.038 (0.7); 4.020 (0.7); 3.736 (0.3); 3.713 (0.4); 3.326 (16.2); 3.049 (0.4); 2.716 (0.4); 2.707 (0.5); 2.700 (0.5); 2.677 (1.1); 2.658 (0.5); 2.650 (0.6); 2.642 (0.6); 2.609 (0.4); 2.602 (0.4); 2.507 (10.8); 2.502 (13.9); 2.498 (10.1); 1.989 (2.9); 1.723 (0.4); 1.664 (0.5); 1.633 (0.5);</p>

[0510]

1.603 (0.5); 1.572 (0.4); 1.499 (0.3); 1.462 (0.4); 1.431 (15.6); 1.414 (16.0); 1.193 (0.8); 1.175 (1.5); 1.157 (0.8); 0.008 (0.7); 0.000 (18.5); -0.008 (0.8)
实施例 IV-01: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 8.315 (0.4); 7.385 (1.5); 7.370 (1.3); 7.252 (2.4); 7.239 (3.5); 7.220 (0.5); 7.208 (1.5); 7.120 (1.7); 7.104 (4.9); 7.073 (5.9); 7.049 (3.5); 7.024 (0.3); 6.969 (1.9); 6.938 (1.6); 6.849 (0.8); 6.791 (5.4); 6.771 (6.3); 5.755 (3.5); 5.362 (0.5); 4.259 (0.6); 4.249 (0.9); 4.240 (1.5); 4.231 (3.0); 4.227 (2.1); 4.222 (3.2); 4.216 (3.9); 4.213 (3.9); 4.209 (4.0); 4.205 (3.2); 4.199 (3.8); 4.192 (3.4); 4.181 (1.5); 4.174 (1.1); 4.165 (0.5); 4.099 (0.5); 4.081 (0.5); 3.954 (0.6); 3.944 (1.0); 3.932 (0.7); 3.921 (0.7); 3.909 (1.1); 3.899 (0.6); 3.792 (0.5); 3.783 (0.7); 3.777 (0.7); 3.767 (0.7); 3.759 (0.7); 3.750 (0.8); 3.743 (0.8); 3.733 (0.6); 3.535 (1.1); 3.523 (0.5); 3.515 (0.6); 3.508 (0.6); 3.498 (0.6); 3.488 (0.7); 3.475 (0.9); 3.464 (0.6); 3.420 (0.8); 3.409 (0.6); 3.394 (0.8); 3.384 (1.2); 3.355 (0.7); 3.347 (0.9); 3.324 (41.7); 3.300 (0.8); 3.292 (0.6); 3.267 (0.8); 3.260 (1.0); 3.242 (1.0); 3.234 (1.2); 3.224 (0.7); 3.207 (0.8); 3.199 (0.8); 3.193 (0.8); 3.185 (0.9); 3.168 (1.0); 3.159 (1.4); 3.151 (0.9); 3.134 (1.0); 3.126 (1.3); 3.117 (1.1); 3.089 (2.2); 3.078 (2.2); 3.068 (2.5); 3.058 (1.6); 3.044 (0.8); 3.034 (0.4); 2.671 (0.4); 2.524 (1.1); 2.511 (24.7); 2.506 (50.5); 2.502 (66.3); 2.497 (47.1); 2.493 (22.3); 2.328 (0.4); 1.989 (1.0); 1.935 (0.8); 1.925 (0.8); 1.913 (0.7); 1.901 (1.0); 1.889 (1.0); 1.879 (0.9); 1.869 (0.7); 1.861 (0.7); 1.852 (0.7); 1.844 (0.8); 1.835 (0.9); 1.826 (0.9); 1.813 (0.9); 1.803 (0.9); 1.790 (0.7); 1.779 (0.9); 1.769 (0.8); 1.735 (0.4); 1.714 (1.0); 1.702 (0.9); 1.688 (1.5); 1.675 (1.0); 1.662 (1.0); 1.641 (0.4); 1.586 (1.1); 1.571 (1.5); 1.561 (1.7); 1.546 (1.0); 1.537 (1.4); 1.528 (0.9); 1.513 (0.4); 1.218 (6.1); 1.207 (8.1); 1.200 (13.0); 1.190 (16.0); 1.182 (6.5); 1.172 (7.4); 1.157 (0.4); 1.083 (0.4); 1.074 (0.4); 1.059 (0.8); 1.050 (1.0); 1.040 (0.6); 1.026 (1.0); 1.017 (0.7); 1.002 (0.4); 0.008 (1.2); 0.000 (35.4); -0.009 (1.2)
实施例 IV-02: ¹H-NMR (400.0 MHz, d₆-DMSO):
δ= 7.385 (7.1); 7.373 (16.0); 7.362 (1.4); 7.352 (1.9); 7.344 (1.6); 7.331 (1.3); 7.324 (0.6); 7.318 (0.6); 7.310 (0.3); 5.133 (12.6); 4.055 (0.4); 4.038 (1.1); 4.020 (1.1); 4.002 (0.4); 3.801 (0.5); 3.786 (0.7); 3.776 (0.6); 3.767 (0.6); 3.757 (0.7); 3.753 (0.7); 3.743 (0.5); 3.626 (7.6); 3.623 (7.2); 3.571 (0.5); 3.561 (0.6); 3.557 (0.6); 3.547 (0.5); 3.536 (0.6); 3.526 (0.7); 3.512 (0.6); 3.327 (14.5); 3.299 (0.7); 3.291 (0.8); 3.277 (0.8); 3.268 (0.9); 3.256 (0.6); 3.242 (0.6); 3.234 (0.6); 3.220 (0.6); 3.212 (0.7); 3.198 (0.7); 3.188 (1.0); 3.178 (0.6); 3.164

[0511]

(0.6); 3.156 (0.6); 3.110 (0.3); 3.100 (0.7); 3.089 (1.0); 3.078 (1.4); 3.068 (1.0); 3.056 (0.7); 3.046 (0.4); 2.510 (6.8); 2.506 (13.2); 2.501 (17.0); 2.497 (12.2); 1.988 (4.6); 1.852 (1.0); 1.842 (1.1); 1.827 (1.3); 1.818 (1.3); 1.795 (0.3); 1.686 (0.4); 1.677 (0.4); 1.664 (0.7); 1.654 (0.9); 1.642 (0.6); 1.631 (0.8); 1.621 (0.5); 1.609 (0.6); 1.601 (0.6); 1.588 (0.7); 1.578 (0.9); 1.567 (0.6); 1.555 (0.8); 1.545 (0.6); 1.192 (1.2); 1.175 (2.4); 1.157 (1.2); 0.000 (5.6)
实施例 IV-03: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 7.411 (0.5); 7.383 (16.0); 7.378 (15.6); 7.368 (3.2); 7.346 (1.5); 7.334 (0.7); 6.028 (4.2); 6.009 (4.2); 5.274 (1.2); 5.267 (1.2); 5.243 (3.7); 5.236 (3.7); 5.217 (3.5); 5.208 (3.5); 5.186 (1.1); 5.177 (1.1); 4.055 (0.9); 4.038 (2.9); 4.020 (2.9); 4.002 (1.0); 3.834 (0.4); 3.824 (0.6); 3.811 (0.5); 3.799 (0.9); 3.789 (1.2); 3.766 (0.6); 3.751 (0.7); 3.741 (0.5); 3.683 (0.9); 3.672 (1.0); 3.661 (0.9); 3.648 (1.1); 3.638 (1.1); 3.391 (0.6); 3.383 (0.8); 3.370 (1.0); 3.358 (1.3); 3.349 (1.2); 3.324 (22.2); 3.272 (0.5); 3.264 (0.6); 3.240 (1.2); 3.211 (1.2); 3.186 (0.5); 3.178 (0.5); 3.139 (0.7); 3.129 (1.1); 3.118 (1.6); 3.108 (1.7); 3.097 (1.2); 3.086 (0.8); 2.524 (0.5); 2.510 (13.0); 2.506 (26.3); 2.501 (34.5); 2.497 (24.9); 2.493 (12.2); 1.988 (12.5); 1.883 (2.1); 1.850 (1.2); 1.825 (0.4); 1.735 (0.3); 1.721 (0.6); 1.712 (0.7); 1.699 (0.5); 1.688 (0.7); 1.679 (0.5); 1.666 (0.5); 1.658 (0.5); 1.645 (0.6); 1.635 (0.9); 1.620 (1.0); 1.606 (1.5); 1.596 (1.6); 1.584 (1.2); 1.573 (1.3); 1.563 (0.9); 1.550 (0.5); 1.541 (0.4); 1.398 (0.6); 1.193 (3.3); 1.175 (6.6); 1.157 (3.3); 0.008 (1.0); 0.000 (27.4); -0.008 (1.0)
实施例 IV-04: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 7.952 (2.2); 7.396 (0.7); 7.386 (0.6); 7.377 (1.5); 7.368 (5.2); 7.360 (5.2); 7.356 (4.9); 7.345 (1.1); 7.335 (0.7); 7.321 (0.4); 7.309 (0.5); 7.263 (0.7); 7.242 (1.1); 7.209 (0.5); 7.131 (0.5); 7.106 (1.2); 7.089 (1.3); 7.074 (1.1); 7.058 (1.1); 6.971 (0.6); 6.939 (0.5); 6.897 (1.6); 6.877 (1.8); 5.293 (0.6); 5.284 (0.6); 5.262 (1.5); 5.253 (1.6); 5.229 (1.4); 5.218 (1.6); 5.198 (0.5); 5.187 (0.6); 3.366 (0.4); 3.329 (19.4); 3.212 (0.4); 3.182 (0.4); 3.156 (0.4); 3.078 (0.5); 3.068 (0.7); 3.058 (0.8); 3.045 (0.8); 3.036 (0.6); 2.890 (16.0); 2.731 (13.5); 2.524 (0.4); 2.510 (7.0); 2.506 (14.1); 2.502 (18.7); 2.497 (13.5); 2.493 (6.6); 1.871 (0.3); 1.633 (0.4); 1.622 (0.4); 1.611 (0.4); 1.599 (0.4); 1.588 (0.4); 1.578 (0.3); 1.553 (0.3); 1.529 (0.5); 1.520 (0.4)
实施例 IV-05: ¹ H-NMR (400.0 MHz, CD ₃ CN): δ = 3.325 (3.4); 3.297 (0.3); 3.293 (0.4); 3.271 (0.3); 2.950 (0.4); 2.171 (3.6); 1.972 (1.3); 1.959 (0.4); 1.953 (1.6); 1.947 (2.8); 1.941 (3.8);

[0512]

1.934 (2.7); 1.928 (1.5); 1.918 (0.3); 1.908 (0.3); 1.902 (0.4); 1.526 (0.4); 1.490 (1.4); 1.464 (1.2); 1.450 (1.4); 1.437 (16.0); 1.431 (4.2); 1.222 (0.4); 1.204 (0.7); 1.186 (0.4); 0.000 (5.2)
实施例 IV-06: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO):
δ= 5.812 (1.6); 5.796 (1.6); 4.055 (0.4); 4.038 (1.3); 4.020 (1.3); 4.002 (0.4); 3.808 (0.4); 3.685 (0.4); 3.650 (0.5); 3.369 (6.2); 3.342 (0.5); 3.334 (0.3); 3.247 (0.3); 3.236 (0.4); 3.226 (0.3); 3.213 (0.3); 3.202 (0.4); 3.170 (0.4); 3.161 (0.5); 3.150 (0.6); 3.137 (0.6); 3.127 (0.4); 2.565 (4.0); 2.511 (6.5); 2.507 (13.2); 2.502 (17.2); 2.498 (12.1); 2.493 (5.6); 1.989 (6.0); 1.951 (0.4); 1.944 (0.4); 1.909 (0.6); 1.888 (0.4); 1.871 (0.5); 1.865 (0.5); 1.731 (0.3); 1.698 (0.4); 1.634 (0.3); 1.624 (0.4); 1.611 (0.4); 1.601 (0.5); 1.591 (0.4); 1.578 (0.4); 1.511 (1.3); 1.477 (2.4); 1.453 (1.0); 1.425 (16.0); 1.417 (15.0); 1.381 (0.4); 1.193 (1.6); 1.175 (3.2); 1.157 (1.5); 0.000 (5.4)
实施例 IV-07: ¹ H-NMR (400.0 MHz, d ₆ -DMSO):
δ= 7.382 (0.4); 7.371 (0.3); 7.247 (0.6); 7.234 (0.7); 7.202 (0.4); 7.116 (0.4); 7.105 (0.4); 7.098 (1.0); 7.067 (1.6); 7.037 (0.9); 6.963 (0.5); 6.932 (0.4); 6.850 (0.4); 6.622 (1.3); 6.595 (1.6); 4.056 (0.4); 4.038 (1.1); 4.020 (1.1); 4.002 (0.5); 3.427 (0.4); 3.402 (0.4); 3.390 (0.5); 3.381 (0.4); 3.328 (11.1); 3.131 (0.4); 3.112 (0.5); 3.105 (0.7); 3.091 (0.5); 3.079 (0.7); 3.072 (0.6); 3.061 (0.4); 3.051 (0.4); 2.506 (14.4); 2.502 (18.6); 2.498 (13.6); 1.989 (4.6); 1.694 (0.4); 1.672 (0.4); 1.548 (0.5); 1.540 (0.4); 1.532 (0.3); 1.523 (0.4); 1.417 (13.8); 1.408 (16.0); 1.193 (1.2); 1.175 (2.4); 1.157 (1.2); 0.000 (4.5)

尖锐信号的强度与 NMR 谱的打印实例中的信号高度 (以 cm 计) 相关, 并显示出信号强度的真实比例关系。在宽信号的情况下, 可显示多个峰或中间信号及其与谱中最强信号相比的相对强度。

为校准 ¹H 谱的化学位移, 使用四甲基硅烷和/或所使用的溶剂的化学位移 (特别是在 DMSO 中所测量的谱的情况下)。因此, 在 NMR 峰列表中, 可存在但并不必然存在四甲基硅烷峰。

¹H-NMR 峰的列表类似于标准的 ¹H-NMR 打印件, 并因此通常包含列在标准 NMR 解析中的所有峰。

此外, 类似于标准的 ¹H NMR 打印件, 其可以显示出溶剂的信号、目标化合物的立体异构体——其也是本发

[0513]

明的主题——的信号、和/或杂质的信号。

为显示在溶剂和/或水的 δ 范围内的化合物信号，本文的 $^1\text{H-NMR}$ 峰列表出了常用溶剂峰，例如 DMSO-d_6 中的 DMSO 峰，以及水峰，其通常具有平均而言高的强度。

目标化合物的立体异构体峰和/或杂质峰通常具有平均而言比目标化合物（例如具有 $>90\%$ 的纯度）峰更低的强度。

对于特定制备方法而言，所述立体异构体和/或杂质可能是典型的。因此，它们的峰能够根据“副产物指纹”帮助鉴定本发明制备方法的再现性。

如果需要，通过已知方法（Mestrec, ACD 模拟，也可以使用根据经验评估的预期值）计算目标化合物峰的专家可任选地使用其他强度滤波器分离目标化合物峰。所述分离类似于标准 $^1\text{H-NMR}$ 解析中相应的峰值拾取法。

更加详细的峰列表的 NMR 数据说明可参见出版物研究数据库编号 564025(Research Disclosure Database Number 564025)的“专利申请中的 NMR 峰列表举例(Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications)”。

[0514] 用途实施例

[0515] 实施例1

[0516] 致病疫霉 (*Phytophthora infestans*) 体外细胞实验

[0517] 溶剂: DMSO

[0518] 培养基: 14.6g 无水 D-葡萄糖 (VWR)、7.1g 真菌蛋白胨 (Oxoid)、1.4g 颗粒状酵母提取物 (Merck)、QSP 1 升

[0519] 接种物: 孢子 (sporocyste) 悬浮液

[0520] 将杀真菌剂溶于 DMSO 中, 该溶液用于制备所需的浓度范围。实验中所用的 DMSO 的终浓度 $\leq 1\%$ 。

[0521] 制备致病疫霉的孢子悬浮液并稀释至所需的孢子密度。

[0522] 评价杀真菌剂在液体培养实验中抑制孢子发芽和菌丝体生长的能力。将化合物以所需浓度加入有孢子的培养基中。孵育 8 天后, 通过菌丝体生长的光谱测量来测定化合物的真菌毒性。将含有杀真菌剂的孔中的吸光度值与不含杀真菌剂的对照孔中的吸光度进行对比以测定真菌生长的抑制。

[0523] 在本实验中, 以下化合物在 $20\mu\text{g}/\text{mL}$ 的活性成分浓度下显示出 70% 或甚至更高的功效。

实施例	功效%	I-34	100
I-01	100	I-40	100
I-03	99	I-41	100
I-06	100	I-42	100
I-08	99	I-44	100
I-09	98	I-45	100
I-10	97	I-46	100
I-11	100	I-47	100
I-16	100	I-49	100
I-19	100	I-50	98
I-20	100	I-51	100
I-25	100	I-52	87
I-26	100	I-53	100
I-27	100	I-55	100
I-28	100	I-56	100
I-33	100	I-58	100

[0525] 在本实验中, 以下化合物在 $0.25\mu\text{g}/\text{mL}$ 的活性成分浓度下显示出 70% 或甚至更高的功效。

[0526]

实施例	功效%
I-02	100
I-04	100
I-05	100
I-07	100
I-13	94

I-17	100
I-23	100
I-38	100
I-59	100
I-60	100
I-61	100
I-62	100
I-63	100
I-64	100
I-65	100
I-66	100
I-71	100
I-78	88
I-80	100

[0527] 实施例2

[0528] 终极腐霉 (*Pythium ultimum*) 体外细胞实验

[0529] 溶剂: DMSO

[0530] 培养基: 14.6g 无水D-葡萄糖 (VWR)、7.1g 真菌蛋白胨 (Oxoid)、1.4g 颗粒状酵母提取物 (Merck)、QSP 1升

[0531] 接种物: 菌丝悬浮液

[0532] 将杀真菌剂溶于DMSO中, 该溶液用于制备所需的浓度范围。实验中所用的DMSO的终浓度 $\leq 1\%$ 。

[0533] 使用搅拌器将生长在液体培养基中的终极腐霉的预培养物均质化而制备接种物。评估接种物中经研磨的菌丝体的浓度并将其调整至所需光密度 (OD)。

[0534] 评价杀真菌剂在液体培养实验中抑制菌丝体生长的能力。将化合物以所需浓度加入含有菌丝悬浮液的培养基中。孵育4天后, 通过菌丝体生长的光谱测量来测定化合物的杀真菌功效。将含有杀真菌剂的孔中的吸光度值与不含杀真菌剂的对照孔中的吸光度进行对比以测定真菌生长的抑制。

[0535] 在本实验中, 以下化合物在20 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 的活性成分浓度下显示出70%或甚至更高的功效。

实施例	功效%	I-34	94
I-01	95	I-40	93
I-03	96	I-41	99
I-04	92	I-42	100
I-05	87	I-44	99
I-06	94	I-46	97
I-08	87	I-47	93
I-09	97	I-49	88
I-11	97	I-50	94
I-16	94	I-51	95
I-20	87	I-52	86
I-26	100	I-55	70
I-27	100	I-56	84
I-33	99		

[0537] 在本实验中,以下化合物在0.25 μ g/mL的活性成分浓度下显示出70%或甚至更高的功效。

[0538]

实施例	功效%
I-02	96
I-07	97
I-17	99
I-38	99
I-63	90
I-65	91

[0539] 实施例3

[0540] 疫霉属实验(番茄)/预防性

[0541] 溶剂:24.5重量份丙酮

[0542] 24.5重量份二甲基乙酰胺

[0543] 乳化剂:1重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0544] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将该浓缩液用水稀释至所需浓度。

[0545] 为测试预防活性,用活性化合物制剂以所述施用率对幼小植株进行喷雾。喷雾涂层变干后,用致病疫霉(*Phytophthora infestans*)的水性孢子悬浮液对该植株进行接种。然后将该植株置于约20 $^{\circ}$ C、相对大气湿度为100%的培养箱中。

[0546] 接种后3天对本实验进行评价。0%意指相当于未处理的对照的功效,而100%的功效意指未观察到病害。

[0547] 在本实验中,本发明的以下化合物在100ppm的活性成分浓度下表现出70%或甚至更高的功效。

[0548]

实施例	功效%
I-01	70
I-02	96
I-03	95
I-05	96
I-08	95
I-16	98

[0549] 在本实验中,本发明的以下化合物在1ppm的活性成分浓度下表现出70%或甚至更高的功效。

[0550]

实施例	功效%
I-41	94
I-42	94

[0551] 实施例4

[0552] 单轴霉属实验(葡萄藤)/预防性

[0553] 溶剂:24.5重量份丙酮

[0554] 24.5重量份二甲基乙酰胺

[0555] 乳化剂:1重量份烷基芳基聚乙二醇醚

[0556] 为制备合适的活性化合物制剂,将1重量份的活性化合物与所述量的溶剂和乳化剂混合,并将该浓缩液用水稀释至所需浓度。

[0557] 为测试预防活性,用活性化合物制剂以所述施用率对幼小植株进行喷雾。喷雾涂层变干后,用葡萄生轴霜霉(*Plasmopara viticola*)的水性孢子悬浮液对该植株进行接种然后在约20℃、相对大气湿度为100%的培养箱中放置1天。然后将该植物在约21℃、相对大气湿度为90%的温室中放置4天。然后使植物蒙雾并在培养箱中放置1天。

[0558] 接种后6天对本实验进行评价。0%意指相当于未处理的对照的功效,而100%的功效意指未观察到病害。

[0559] 在本实验中,本发明的以下化合物在100ppm的活性成分浓度下表现出70%或甚至更高的功效。

[0560]

实施例	功效%
I-02	100
I-03	98
I-05	95
I-08	98
I-16	95

[0561] 在本实验中,本发明的以下化合物在1ppm的活性成分浓度下表现出70%或甚至更高的功效。

[0562]

实施例	功效%
I-38	93
I-41	91
I-42	99
I-44	82
I-51	94