



# (12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 115232083 A

(43) 申请公布日 2022. 10. 25

(21) 申请号 202110435945.6

A01P 3/00 (2006.01)

(22) 申请日 2021.04.22

A01P 1/00 (2006.01)

(71) 申请人 沈阳中化农药化工研发有限公司  
地址 110021 辽宁省沈阳市铁西区沈辽东  
路8-1号

申请人 江苏扬农化工股份有限公司

(72) 发明人 李森 杨吉春 赵杰 吴峤  
李志念 刘长令

(74) 专利代理机构 沈阳科苑专利商标代理有限  
公司 21002

专利代理师 李颖

(51) Int. Cl.

C07D 261/08 (2006.01)

C07D 417/12 (2006.01)

A01N 43/80 (2006.01)

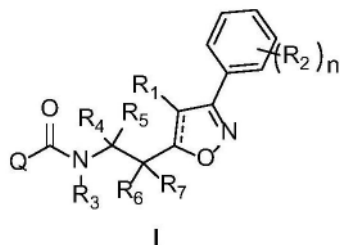
权利要求书6页 说明书26页

(54) 发明名称

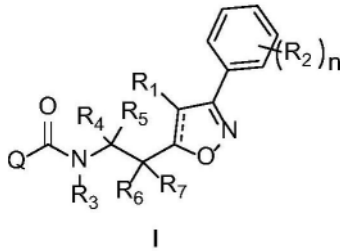
取代异噁唑乙胺类化合物及其制备方法和用途

(57) 摘要

本发明公开了一种取代异噁唑乙胺类化合物,结构如通式I所示;式中各取代基的定义见说明书。本发明的化合物具有广谱杀菌活性,对黄瓜霜霉病、白粉病、玉米锈病、炭疽病、稻瘟病等具有优良的防治效果。



1. 一种取代异噻唑乙胺类化合物,其特征在于:取代异噻唑乙胺类化合物为通式I所示化合物;



式中:

$R_1$ 选自氢、 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_3-C_{12}$ 环烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基、 $C_2-C_{12}$ 烯基、卤代 $C_2-C_{12}$ 烯基、 $C_2-C_{12}$ 炔基、卤代 $C_2-C_{12}$ 炔基、 $C_3-C_{12}$ 烯氧基、卤代 $C_3-C_{12}$ 烯氧基、 $C_3-C_{12}$ 炔氧基、卤代 $C_3-C_{12}$ 炔氧基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基、 $C_1-C_{12}$ 烷基或 $C_1-C_{12}$ 烷硫基、 $C_1-C_{12}$ 烷基;

$R_2$ 选自卤素、羟基、氨基、氰基、硝基、 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基、 $C_3-C_{12}$ 环烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷基氨基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基氨基、二( $C_1-C_{12}$ 烷基)氨基、二(卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基)氨基、 $C_1-C_{12}$ 烷硫基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷硫基、 $C_2-C_{12}$ 烯基、 $C_2-C_{12}$ 炔基、 $C_2-C_{12}$ 烯氧基、卤代 $C_2-C_{12}$ 烯氧基、 $C_2-C_{12}$ 炔氧基、卤代 $C_2-C_{12}$ 炔氧基、 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷硫基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷硫基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷硫基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷硫基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基氧基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基氧基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基氧基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基氧基、 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基氧基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基氧基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷氧基, $R_2$ 处于苯环4位时,不选自氰基或者羟基;

$n$ 选自0至5的整数,当 $n$ 为0时,无取代基;当 $n$ 大于1时, $R_2$ 相同或不同;

$R_3$ 选自氢、羟基、甲酰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基、 $C_3-C_{12}$ 环烷基、 $C_2-C_{12}$ 烯基、 $C_2-C_{12}$ 炔基、卤代 $C_2-C_{12}$ 烯基、卤代 $C_2-C_{12}$ 炔基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷硫基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷硫基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷基亚磺酰基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基氨基磺酰基、二( $C_1-C_{12}$ 烷基)氨基磺酰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基氨基羰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基氨基磺酰基、 $C_3-C_{12}$ 环烷基氧基羰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷基氨基羰基、二( $C_1-C_{12}$ 烷基)氨基羰基、 $C_2-C_{12}$ 烯氧基羰基、 $C_2-C_{12}$ 炔氧基羰基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基、未取代的或被1-5个如下基团取代的芳基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、芳基羰基、芳氧基羰基、芳基 $C_1-C_6$ 烷基氧基羰基、芳基 $C_1-C_6$ 烷基、杂芳基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、杂芳基羰基、杂芳氧基羰基、杂芳基 $C_1-C_6$ 烷基氧基羰基、杂芳基 $C_1-C_6$ 烷基,如下基团为卤素、硝基、氰基、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基;

$R_4$ 、 $R_5$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基;

其中, $R_4$ 、 $R_5$ 与其相连的C还可以组成 $C_3-C_8$ 的环;

$R_6$ 、 $R_7$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基或卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基；

其中， $R_6$ 、 $R_7$ 与其相连的C还可以组成 $C_3$ - $C_8$ 的环；

Q选自未取代或被1-5个 $R_8$ 取代的芳基、杂芳基；

$R_8$ 选自卤素、羟基、氨基、氰基、硝基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基、卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_{12}$ 环烷基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基氨基、卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基氨基、二( $C_1$ - $C_{12}$ 烷基)氨基、卤代二( $C_1$ - $C_{12}$ 烷基)氨基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷硫基、卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷硫基、 $C_2$ - $C_{12}$ 烯基、 $C_2$ - $C_{12}$ 炔基、 $C_2$ - $C_{12}$ 烯氧基、卤代 $C_2$ - $C_{12}$ 烯氧基、 $C_2$ - $C_{12}$ 炔氧基、卤代 $C_2$ - $C_{12}$ 炔氧基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基羰基、卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基羰基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷硫基 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷硫基 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基羰基 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基羰基 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷硫基羰基 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷硫基羰基 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基羰基氧基、卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基羰基氧基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基羰基氧基、卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基羰基氧基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基磺酰基氧基、卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷基磺酰基氧基、 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基或卤代 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基 $C_1$ - $C_{12}$ 烷氧基。

2. 根据权利要求1所述的取代异噁唑乙胺类化合物，其特征在于：所述通式I化合物中：

$R_1$ 选自氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、卤代 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、卤代 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_3$ - $C_6$ 烯氧基、卤代 $C_3$ - $C_6$ 烯氧基、 $C_3$ - $C_6$ 炔氧基、卤代 $C_3$ - $C_6$ 炔氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基 $C_1$ - $C_6$ 烷基或 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基 $C_1$ - $C_6$ 烷基；

$R_2$ 选自卤素、羟基、氨基、氰基、硝基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基、二( $C_1$ - $C_6$ 烷基)氨基、二(卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷基)氨基、 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_2$ - $C_6$ 烯氧基、卤代 $C_2$ - $C_6$ 烯氧基、 $C_2$ - $C_6$ 炔氧基、卤代 $C_2$ - $C_6$ 炔氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基氧基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基氧基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺酰基氧基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺酰基氧基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基或卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基， $R_2$ 处于苯环4位时，不选自氰基或者羟基；

$n$ 选自0至5的整数，当 $n$ 为0时，无取代基；当 $n$ 大于1时， $R_2$ 相同或不同；

$R_3$ 选自氢、羟基、甲酰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、卤代 $C_2$ - $C_6$ 烯基、卤代 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷硫基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基亚磺酰基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基磺酰基、二( $C_1$ - $C_6$ 烷基)氨基磺酰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺酰基氨基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基氨基磺酰基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基氧基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、二( $C_1$ - $C_6$ 烷基)氨基羰基、 $C_2$ - $C_6$ 烯氧基羰基、 $C_2$ - $C_6$ 炔氧基羰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基、未取代的或被1-5个如下基团取代的芳基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、芳基羰基、芳氧基羰基、芳基 $C_1$ - $C_6$ 烷基氧基羰基、芳基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、杂芳基羰基 $C_1$ - $C_6$ 烷基、杂芳基羰基、杂芳氧基羰基、杂芳基 $C_1$ - $C_6$ 烷基

氧基羰基、杂芳基 $C_1-C_6$ 烷基,如下基团为卤素、硝基、氰基、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基;

$R_4$ 、 $R_5$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基;

其中, $R_4$ 、 $R_5$ 与其相连的C还可以组成 $C_3-C_6$ 的环;

$R_6$ 、 $R_7$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基;

其中, $R_6$ 、 $R_7$ 与其相连的C还可以组成 $C_3-C_6$ 的环;

Q选自未取代或被1-5个 $R_8$ 取代的芳基、杂芳基;

$R_8$ 选自卤素、羟基、氨基、氰基、硝基、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_3-C_6$ 环烷基、 $C_1-C_6$ 烷基氨基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基氨基、二( $C_1-C_6$ 烷基)氨基、卤代二( $C_1-C_6$ 烷基)氨基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、卤代 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_2-C_6$ 烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_2-C_6$ 烯氧基、卤代 $C_2-C_6$ 烯氧基、 $C_2-C_6$ 炔氧基、卤代 $C_2-C_6$ 炔氧基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基羰基、 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷硫基 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷硫基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷硫基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷硫基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基羰基氧基、 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基氧基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基氧基、 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷氧基。

3. 根据权利要求2所述的取代异噁唑乙胺类化合物,其特征在于:所述通式I化合物中:

$R_1$ 选自氢、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_2-C_6$ 烯基、卤代 $C_2-C_6$ 烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、卤代 $C_2-C_6$ 炔基;

$R_2$ 选自卤素、羟基、氨基、氰基、硝基、 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_1-C_4$ 烷基氨基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基氨基、二( $C_1-C_4$ 烷基)氨基、二(卤代 $C_1-C_4$ 烷基)氨基、 $C_1-C_4$ 烷硫基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基、 $C_2-C_4$ 烯基、 $C_2-C_4$ 炔基、 $C_2-C_4$ 烯氧基、卤代 $C_2-C_4$ 烯氧基、 $C_2-C_4$ 炔氧基、卤代 $C_2-C_4$ 炔氧基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_4$ 烷基羰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基羰基、 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基、 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷硫基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷硫基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷基羰基氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基羰基氧基、 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基氧基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基氧基、 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷氧基, $R_2$ 处于苯环4位时,不选自氰基或者羟基;

n选自0至5的整数,当n为0时,无取代基;当n大于1时, $R_2$ 相同或不同;

$R_3$ 选自氢、羟基、甲酰基、 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_2-C_4$ 烯基、 $C_2-C_4$ 炔基、卤代 $C_2-C_4$ 烯基、卤代 $C_2-C_4$ 炔基、 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷硫基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷基亚磺酰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_4$ 烷基氨基磺酰基、二( $C_1-C_4$ 烷基)氨基磺酰基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基氨基羰基、 $C_1-C_4$ 烷基羰基氨基磺酰基、 $C_3-C_4$ 环烷基氧基羰基、 $C_1-C_4$ 烷基羰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基羰基、 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基

基；

$R_4$ 、 $R_5$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基或卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基；

其中， $R_4$ 、 $R_5$ 与其相连的C还可以组成 $C_3$ - $C_4$ 的环；

$R_6$ 、 $R_7$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基或卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基；

其中， $R_6$ 、 $R_7$ 与其相连的C还可以组成 $C_3$ - $C_4$ 的环；

Q选自未取代或被1-5个 $R_8$ 取代的苯基、吡啶基、噻吩基、呋喃基、吡唑基、噻唑基、异噻唑基、吡嗪、哒嗪；

$R_8$ 选自卤素、羟基、氨基、氰基、硝基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基氨基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基氨基、二( $C_1$ - $C_4$ 烷基)氨基、卤代二( $C_1$ - $C_4$ 烷基)氨基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基、 $C_2$ - $C_4$ 烯基、 $C_2$ - $C_4$ 炔基、 $C_2$ - $C_4$ 烯氧基、卤代 $C_2$ - $C_4$ 烯氧基、 $C_2$ - $C_4$ 炔氧基、卤代 $C_2$ - $C_4$ 炔氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基氧基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基氧基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基氧基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基磺酰基氧基或卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基磺酰基氧基。

4. 根据权利要求3所述的取代异噁唑乙胺类化合物，其特征在于：所述通式I化合物中：

$R_1$ 选自氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、卤代 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、卤代 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、卤代 $C_2$ - $C_6$ 炔基；

$R_2$ 选自卤素、羟基、氨基、氰基、硝基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基氨基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基氨基、二( $C_1$ - $C_4$ 烷基)氨基、二(卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基)氨基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基、 $C_2$ - $C_4$ 烯基、 $C_2$ - $C_4$ 炔基、 $C_2$ - $C_4$ 烯氧基、卤代 $C_2$ - $C_4$ 烯氧基、 $C_2$ - $C_4$ 炔氧基、卤代 $C_2$ - $C_4$ 炔氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基氧基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基氧基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基氧基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基磺酰基氧基或卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基磺酰基氧基， $R_2$ 处于苯环4位时，不选自氰基或者羟基；

n选自0至5的整数，当n为0时，无取代基；当n大于1时， $R_2$ 相同或不同；

$R_3$ 选自氢、羟基、甲酰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、 $C_2$ - $C_4$ 烯基、 $C_2$ - $C_4$ 炔基、卤代 $C_2$ - $C_4$ 烯基、卤代 $C_2$ - $C_4$ 炔基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基 $C_1$ - $C_4$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基 $C_1$ - $C_4$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基亚磺酰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基氨基磺酰基、二( $C_1$ - $C_4$ 烷基)氨基磺酰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基氨基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基氨基磺酰基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基氧基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基

基；

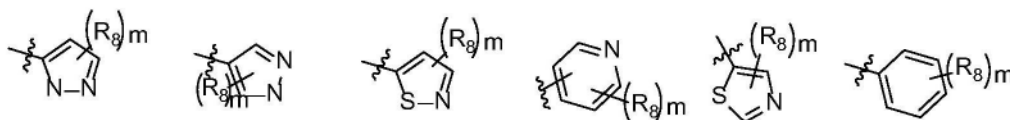
$R_4$ 、 $R_5$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基或卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基；

其中， $R_4$ 、 $R_5$ 与其相连的C还可以组成 $C_3$ - $C_4$ 的环；

$R_6$ 、 $R_7$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基或卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基；

其中， $R_6$ 、 $R_7$ 与其相连的C还可以组成 $C_3$ - $C_4$ 的环；

Q选自如下取代基：



$R_8$ 选自卤素、氨基、氰基、硝基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_3$ - $C_4$ 环烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基氨基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基氨基、二( $C_1$ - $C_4$ 烷基)氨基、卤代二( $C_1$ - $C_4$ 烷基)氨基、氨基羰基、二 $C_1$ - $C_4$ 烷基氨基羰基、二卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基氨基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺酰基；

$m$ 选自0至5的整数，当 $m$ 为0时，无取代基；当 $m$ 大于1时， $R_8$ 相同或不同。

5. 根据权利要求4所述的取代异噁唑乙胺类化合物，其特征在于：通式I所示化合物中：

$R_1$ 选自氢、氰基、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基或三氟甲基；

$R_2$ 选自氟、氯、溴、碘、羟基、氰基、氨基、硝基、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、三氯甲基、二氟一氯甲基、二氯一氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、三氟甲氧基、三氟乙氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基， $R_2$ 处于苯环4位时，不选自氰基或者羟基；

$n$ 选自0至5的整数，当 $n$ 为0时，无取代基；当 $n$ 大于1时， $R_2$ 相同或不同；

$R_3$ 选自氢、羟基、甲酰基、乙酰基、丙酰基、丁酰基、三氟乙酰基、苯甲酰基、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、三氟甲基、三氟乙基、甲氧基、乙氧基、三氟乙氧基、环丙基氧基、烯丙基、炔丙基、甲磺酰基、乙磺酰基、三氟乙基磺酰基、甲氨基磺酰基、乙氨基磺酰基、二甲氨基磺酰基、二乙氨基磺酰基、甲磺酰基氨基羰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、丙氧基羰基、异丙氧基羰基、甲氨基羰基、二甲氨基羰基、乙烯氧基羰基、乙炔氧基羰基；

$R_4$ 、 $R_5$ 相同或不同的分别选自氢、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基或叔丁氧基；

$R_6$ 、 $R_7$ 相同或不同的分别选自氢、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基或叔丁氧基；

Q选自如下取代基：



## 取代异噁唑乙胺类化合物及其制备方法和用途

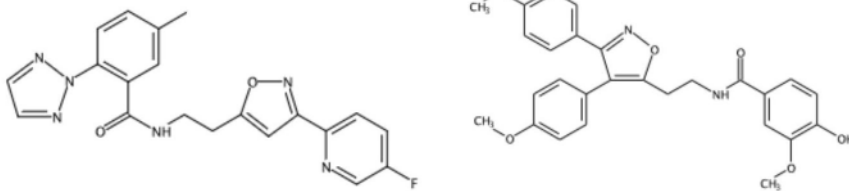
### 技术领域

[0001] 本发明属化学领域,具体涉及一种取代异噁唑乙胺类化合物及其制备方法和作为杀菌剂的用途。

### 背景技术

[0002] 文献Bioorganic&Medicinal Chemistry (2015), 23 (6), 1260-1275和专利W0 9219604公开了如下取代异噁唑乙胺类化合物,其用途均用于医药领域,分别作为受体拮抗剂及脂氧合酶和环氧化酶抑制剂使用。

[0003]



[0004] 现有技术中,公开的化合物虽与本发明化合物有一定的相似之处,但本发明通式所示的化合物与现有技术是有显著区别的,且均具有很好的杀菌活性。

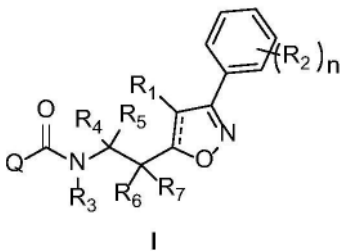
### 发明内容

[0005] 本发明的目的在于提供一种可以控制多种病菌的取代异噁唑乙胺类化合物,及其制备方法和用于农业或其他领域中制备防治病菌的药物的用途。

[0006] 为实现上述目的,本发明的技术方案如下:

[0007] 一种取代异噁唑乙胺类化合物,其特征在于:取代异噁唑乙胺类化合物为通式I所示化合物;

[0008]



[0009] 式中:

[0010] R<sub>1</sub>选自氢、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基、卤代C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基、卤代C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>烯基、卤代C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>炔基、卤代C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>烯氧基、卤代C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>烯氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>炔氧基、卤代C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>炔氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷硫基C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基;

[0011] R<sub>2</sub>选自卤素、羟基、氨基、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基、卤代C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基、卤代C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>12</sub>环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基氨基、卤代C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基氨基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基)氨基、二(卤代C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基)氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷硫基、卤代C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷硫基、C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>烯氧基、卤代C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>烯氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>炔氧基、卤代C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>炔氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基磺酰基、卤代C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基磺酰基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基羰基、卤代C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基羰基、卤代C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>烷氧基羰基、



$C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷硫基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷硫基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷硫基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷硫基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基氧基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基氧基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基氧基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基氧基、 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基氧基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基氧基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷氧基,  $R_2$ 处于苯环4位时,不选自氰基或者羟基;

[0012]  $n$ 选自0至5的整数,当 $n$ 为0时,无取代基;当 $n$ 大于1时, $R_2$ 相同或不同;

[0013]  $R_3$ 选自氢、羟基、甲酰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基、 $C_3-C_{12}$ 环烷基、 $C_2-C_{12}$ 烯基、 $C_2-C_{12}$ 炔基、卤代 $C_2-C_{12}$ 烯基、卤代 $C_2-C_{12}$ 炔基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷硫基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷硫基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷基亚磺酰基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基氨基磺酰基、二( $C_1-C_{12}$ 烷基)氨基磺酰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基氨基羰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基氨基磺酰基、 $C_3-C_{12}$ 环烷基氧基羰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷基氨基羰基、二( $C_1-C_{12}$ 烷基)氨基羰基、 $C_2-C_{12}$ 烯氧基羰基、 $C_2-C_{12}$ 炔氧基羰基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基、未取代的或被1-5个如下基团取代的芳基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、芳基羰基、芳氧基羰基、芳基 $C_1-C_6$ 烷基氧基羰基、芳基 $C_1-C_6$ 烷基、杂芳基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、杂芳基羰基、杂芳氧基羰基、杂芳基 $C_1-C_6$ 烷基氧基羰基、杂芳基 $C_1-C_6$ 烷基,如下基团为卤素、硝基、氰基、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基;

[0014]  $R_4$ 、 $R_5$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基;

[0015] 其中, $R_4$ 、 $R_5$ 与其相连的C还可以组成 $C_3-C_8$ 的环;

[0016]  $R_6$ 、 $R_7$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基;

[0017] 其中, $R_6$ 、 $R_7$ 与其相连的C还可以组成 $C_3-C_8$ 的环;

[0018]  $Q$ 选自未取代或被1-5个 $R_8$ 取代的芳基、杂芳基。

[0019]  $R_8$ 选自卤素、羟基、氨基、氰基、硝基、 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基、 $C_3-C_{12}$ 环烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷基氨基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基氨基、二( $C_1-C_{12}$ 烷基)氨基、卤代二( $C_1-C_{12}$ 烷基)氨基、 $C_1-C_{12}$ 烷硫基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷硫基、 $C_2-C_{12}$ 烯基、 $C_2-C_{12}$ 炔基、 $C_2-C_{12}$ 烯氧基、卤代 $C_2-C_{12}$ 烯氧基、 $C_2-C_{12}$ 炔氧基、卤代 $C_2-C_{12}$ 炔氧基、 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷硫基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷硫基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷硫基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷硫基羰基 $C_1-C_{12}$ 烷基、 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基氧基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基羰基氧基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基氧基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基羰基氧基、 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基氧基、卤代 $C_1-C_{12}$ 烷基磺酰基氧基、 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_{12}$ 烷氧基 $C_1-C_{12}$ 烷氧基。

[0020] 优选,所述通式I化合物中:

[0021]  $R_1$ 选自氢、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_2-C_6$ 烯基、卤代 $C_2-C_6$ 烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、卤代 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_3-C_6$ 烯氧基、卤代 $C_3-C_6$ 烯氧基、 $C_3-C_6$

炔氧基、卤代 $C_3-C_6$ 炔氧基、 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷基或 $C_1-C_6$ 烷硫基 $C_1-C_6$ 烷基；

[0022]  $R_2$ 选自卤素、羟基、氨基、氰基、硝基、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_3-C_6$ 环烷基、 $C_1-C_6$ 烷基氨基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基氨基、二( $C_1-C_6$ 烷基)氨基、二(卤代 $C_1-C_6$ 烷基)氨基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、卤代 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_2-C_6$ 烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_2-C_6$ 烯氧基、卤代 $C_2-C_6$ 烯氧基、 $C_2-C_6$ 炔氧基、卤代 $C_2-C_6$ 炔氧基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基羰基、 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷硫基 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷硫基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷硫基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷硫基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基羰基氧基、 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基氧基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基氧基、 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷氧基， $R_2$ 处于苯环4位时，不选自氰基或者羟基；

[0023]  $n$ 选自0至5的整数，当 $n$ 为0时，无取代基；当 $n$ 大于1时， $R_2$ 相同或不同；

[0024]  $R_3$ 选自氢、羟基、甲酰基、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_3-C_6$ 环烷基、 $C_2-C_6$ 烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、卤代 $C_2-C_6$ 烯基、卤代 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷硫基 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷硫基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基氨基磺酰基、二( $C_1-C_6$ 烷基)氨基磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基氨基羰基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基氨基磺酰基、 $C_3-C_6$ 环烷基氧基羰基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基羰基、 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基氨基羰基、二( $C_1-C_6$ 烷基)氨基羰基、 $C_2-C_6$ 烯氧基羰基、 $C_2-C_6$ 炔氧基羰基、 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基、未取代的或被1-5个如下基团取代的芳基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、芳基羰基、芳氧基羰基、芳基 $C_1-C_6$ 烷基氧基羰基、芳基 $C_1-C_6$ 烷基、杂芳基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、杂芳基羰基、杂芳氧基羰基、杂芳基 $C_1-C_6$ 烷基氧基羰基、杂芳基 $C_1-C_6$ 烷基，如下基团为卤素、硝基、氰基、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基；

[0025]  $R_4$ 、 $R_5$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基；

[0026] 其中， $R_4$ 、 $R_5$ 与其相连的C还可以组成 $C_3-C_6$ 的环；

[0027]  $R_6$ 、 $R_7$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基；

[0028] 其中， $R_6$ 、 $R_7$ 与其相连的C还可以组成 $C_3-C_6$ 的环；

[0029]  $Q$ 选自未取代或被1-5个 $R_8$ 取代的芳基、杂芳基。

[0030]  $R_8$ 选自卤素、羟基、氨基、氰基、硝基、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_3-C_6$ 环烷基、 $C_1-C_6$ 烷基氨基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基氨基、二( $C_1-C_6$ 烷基)氨基、卤代二( $C_1-C_6$ 烷基)氨基、 $C_1-C_6$ 烷硫基、卤代 $C_1-C_6$ 烷硫基、 $C_2-C_6$ 烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_2-C_6$ 烯氧基、卤代 $C_2-C_6$ 烯氧基、 $C_2-C_6$ 炔氧基、卤代 $C_2-C_6$ 炔氧基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基羰基、 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷硫基 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷硫基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷硫基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷硫基羰基 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 烷基羰基氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基羰基氧基、 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基氧

基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基羰基氧基、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基氧基、 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基 $C_1-C_6$ 烷氧基。

[0031] 进一步优选,所述通式I化合物中:

[0032]  $R_1$ 选自氢、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_2-C_6$ 烯基、卤代 $C_2-C_6$ 烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、卤代 $C_2-C_6$ 炔基;

[0033]  $R_2$ 选自卤素、羟基、氨基、氰基、硝基、 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_1-C_4$ 烷基氨基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基氨基、二( $C_1-C_4$ 烷基)氨基、二(卤代 $C_1-C_4$ 烷基)氨基、 $C_1-C_4$ 烷硫基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基、 $C_2-C_4$ 烯基、 $C_2-C_4$ 炔基、 $C_2-C_4$ 烯氧基、卤代 $C_2-C_4$ 烯氧基、 $C_2-C_4$ 炔氧基、卤代 $C_2-C_4$ 炔氧基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_4$ 烷基羰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基羰基、 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基、 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷硫基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷硫基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷基羰基氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基羰基氧基、 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基氧基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基氧基、 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷氧基,  $R_2$ 处于苯环4位时,不选自氰基或者羟基;

[0034]  $n$ 选自0至5的整数,当 $n$ 为0时,无取代基;当 $n$ 大于1时,  $R_2$ 相同或不同;

[0035]  $R_3$ 选自氢、羟基、甲酰基、 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_2-C_4$ 烯基、 $C_2-C_4$ 炔基、卤代 $C_2-C_4$ 烯基、卤代 $C_2-C_4$ 炔基、 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷硫基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷基亚磺酰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_4$ 烷基氨基磺酰基、二( $C_1-C_4$ 烷基)氨基磺酰基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基氨基羰基、 $C_1-C_4$ 烷基羰基氨基磺酰基、 $C_3-C_4$ 环烷基氧基羰基、 $C_1-C_4$ 烷基羰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基羰基、 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基;

[0036]  $R_4$ 、 $R_5$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基;

[0037] 其中,  $R_4$ 、 $R_5$ 与其相连的C还可以组成 $C_3-C_4$ 的环;

[0038]  $R_6$ 、 $R_7$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基;

[0039] 其中,  $R_6$ 、 $R_7$ 与其相连的C还可以组成 $C_3-C_4$ 的环;

[0040]  $Q$ 选自未取代或被1-5个 $R_8$ 取代的苯基、吡啶基、噻吩基、呋喃基、吡唑基、噻唑基、异噻唑基、吡嗪、哒嗪;

[0041]  $R_8$ 选自卤素、羟基、氨基、氰基、硝基、 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_1-C_4$ 烷基氨基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基氨基、二( $C_1-C_4$ 烷基)氨基、卤代二( $C_1-C_4$ 烷基)氨基、 $C_1-C_4$ 烷硫基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基、 $C_2-C_4$ 烯基、 $C_2-C_4$ 炔基、 $C_2-C_4$ 烯氧基、卤代 $C_2-C_4$ 烯氧基、 $C_2-C_4$ 炔氧基、卤代 $C_2-C_4$ 炔氧基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_4$ 烷基羰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基羰基、 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基、 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷硫基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷硫基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷基羰基氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基羰基氧基、 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基氧基

基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基氧基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基氧基、 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷氧基。

[0042] 再进一步优选,所述通式I化合物中:

[0043]  $R_1$ 选自氢、 $C_1-C_6$ 烷基、卤代 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_2-C_6$ 烯基、卤代 $C_2-C_6$ 烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、卤代 $C_2-C_6$ 炔基;

[0044]  $R_2$ 选自卤素、羟基、氨基、氰基、硝基、 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_1-C_4$ 烷基氨基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基氨基、二( $C_1-C_4$ 烷基)氨基、二(卤代 $C_1-C_4$ 烷基)氨基、 $C_1-C_4$ 烷硫基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基、 $C_2-C_4$ 烯基、 $C_2-C_4$ 炔基、 $C_2-C_4$ 烯氧基、卤代 $C_2-C_4$ 烯氧基、 $C_2-C_4$ 炔氧基、卤代 $C_2-C_4$ 炔氧基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_4$ 烷基羰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基羰基、 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基、 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷硫基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷硫基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基羰基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷基羰基氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基羰基氧基、 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基氧基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基氧基、 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷氧基,  $R_2$ 处于苯环4位时,不选自氰基或者羟基;

[0045]  $n$ 选自0至5的整数,当 $n$ 为0时,无取代基;当 $n$ 大于1时,  $R_2$ 相同或不同;

[0046]  $R_3$ 选自氢、羟基、甲酰基、 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_2-C_4$ 烯基、 $C_2-C_4$ 炔基、卤代 $C_2-C_4$ 烯基、卤代 $C_2-C_4$ 炔基、 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷硫基 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷基亚磺酰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基亚磺酰基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、 $C_1-C_4$ 烷基氨基磺酰基、二( $C_1-C_4$ 烷基)氨基磺酰基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基氨基羰基、 $C_1-C_4$ 烷基羰基氨基磺酰基、 $C_3-C_4$ 环烷基氧基羰基、 $C_1-C_4$ 烷基羰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基羰基、 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基羰基;

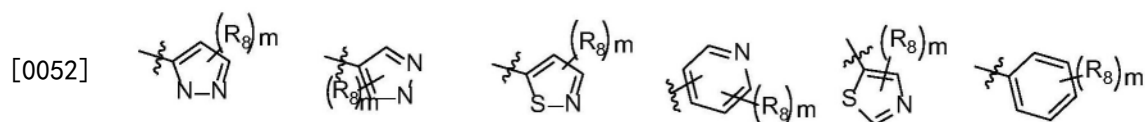
[0047]  $R_4$ 、 $R_5$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基;

[0048] 其中,  $R_4$ 、 $R_5$ 与其相连的C还可以组成 $C_3-C_4$ 的环;

[0049]  $R_6$ 、 $R_7$ 相同或不同的分别选自氢、卤素、 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基或卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基;

[0050] 其中,  $R_6$ 、 $R_7$ 与其相连的C还可以组成 $C_3-C_4$ 的环;

[0051] Q选自如下取代基:



[0053]  $R_8$ 选自卤素、氨基、氰基、硝基、 $C_1-C_4$ 烷基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_4$ 烷氧基、卤代 $C_1-C_4$ 烷氧基、 $C_3-C_4$ 环烷基、 $C_1-C_4$ 烷基氨基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基氨基、二( $C_1-C_4$ 烷基)氨基、卤代二( $C_1-C_4$ 烷基)氨基、氨基羰基、二 $C_1-C_4$ 烷基氨基羰基、二卤代 $C_1-C_4$ 烷基氨基羰基、 $C_1-C_4$ 烷硫基、卤代 $C_1-C_4$ 烷硫基、 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基、卤代 $C_1-C_4$ 烷基磺酰基。

[0054]  $m$ 选自0至5的整数,当 $m$ 为0时,无取代基;当 $m$ 大于1时,  $R_8$ 相同或不同。

[0055] 更进一步优选,通式I所示化合物中:

[0056]  $R_1$ 选自氢、氰基、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基或三氟甲基；

[0057]  $R_2$ 选自氟、氯、溴、碘、羟基、氰基、氨基、硝基、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、三氯甲基、二氟一氯甲基、二氯一氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、三氟甲氧基、三氟乙氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基， $R_2$ 处于苯环4位时，不选自氰基或者羟基；

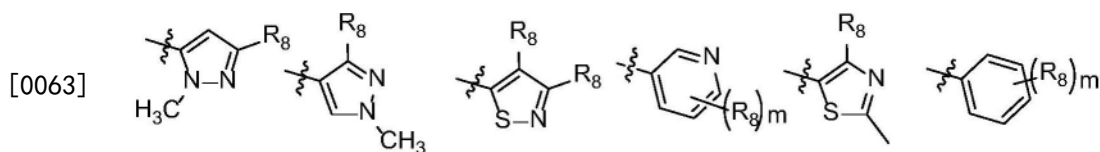
[0058]  $n$ 选自0至5的整数，当 $n$ 为0时，无取代基；当 $n$ 大于1时， $R_2$ 相同或不同；

[0059]  $R_3$ 选自氢、羟基、甲酰基、乙酰基、丙酰基、丁酰基、三氟乙酰基、苯甲酰基、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、三氟甲基、三氟乙基、甲氧基、乙氧基、三氟乙氧基、环丙基氧基、烯丙基、炔丙基、甲磺酰基、乙磺酰基、三氟乙基磺酰基、甲氨基磺酰基、乙氨基磺酰基、二甲氨基磺酰基、二乙氨基磺酰基、甲磺酰基氨基羰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、丙氧基羰基、异丙氧基羰基、甲氨基羰基、二甲氨基羰基、乙烯氧基羰基、乙炔氧基羰基；

[0060]  $R_4$ 、 $R_5$ 相同或不同的分别选自氢、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基或叔丁氧基；

[0061]  $R_6$ 、 $R_7$ 相同或不同的分别选自氢、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基或叔丁氧基；

[0062]  $Q$ 选自如下取代基：



[0064]  $R_8$ 选自氟、氯、溴、碘、氰基、氨基、硝基、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、三氟甲基、二氟甲基、三氯甲基、二氟一氯甲基、二氯一氟甲基、甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基、甲硫基、乙硫基、三氟甲氧基、三氟乙氧基、甲基磺酰基、乙基磺酰基；

[0065]  $m$ 选自0至5的整数，当 $m$ 为0时，无取代基；当 $m$ 大于1时， $R_8$ 相同或不同。

[0066] 再更进一步优选，通式I所示化合物中：

[0067]  $R_1$ 选自氢或甲基；

[0068]  $R_3$ 选自氢；

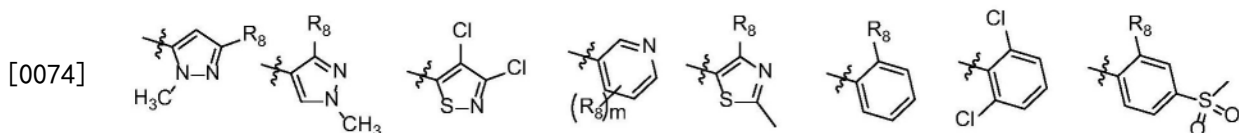
[0069]  $R_2$ 选自氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、二氟甲基、甲氧基、甲硫基或三氟甲氧基， $R_2$ 处于苯环4位时，不选自氰基。

[0070]  $R_4$ 、 $R_5$ 相同或不同的分别选自氢、氟、氯、溴或甲基；

[0071]  $R_6$ 、 $R_7$ 均选自氢；

[0072]  $n$ 选自0至5的整数，当 $n$ 为0时，环上无取代基；当 $n$ 大于1时， $R_2$ 相同或不同；

[0073]  $Q$ 选自如下取代基：



[0075]  $R_8$ 选自氟、氯、溴、碘、氰基、氨基、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、二氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、三氟甲氧基、三氟乙氧基；

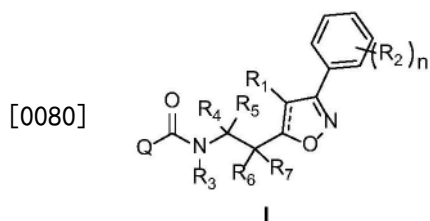
[0076]  $m$ 选自0至4的整数，当 $m$ 为0时，无取代基；当 $m$ 大于1时， $R_8$ 相同或不同。

[0077] 上面给出的通式I化合物的定义中，汇集所用术语一般定义如下：

[0078] 卤素：指氟、氯、溴或碘。烷基：直链或支链烷基，例如甲基、乙基、丙基、异丙基、正丁基或叔丁基。环烷基：取代或未取代的环状烷基，例如环丙基、环戊基或环己基。取代基如甲基、卤素等。卤代烷基：直链或支链烷基，在这些烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，例如，氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基等。烷基亚磺酰基：直链或支链烷基经亚磺酰基(-SO-)连接到结构上，如甲基亚磺酰基。卤代烷基亚磺酰基：直链或支链烷基亚磺酰基，其烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。卤代烷基磺酰基：直链或支链烷基磺酰基，其烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。烷基氨基磺基：如 $CH_3NHS-$ 、 $C_2H_5NHS-$ 。二烷基氨基磺基：如 $(CH_3)_2NS-$ 、 $(C_2H_5)_2NS-$ 。烷基氨基磺酰基：烷基-NH-SO<sub>2</sub>-。二烷基氨基磺酰基：(烷基)<sub>2</sub>-N-SO<sub>2</sub>-。烷基磺酰基氨基羰基：烷基-SO<sub>2</sub>-NH-CO-。烷基羰基氨基磺酰基：烷基-CO-NH-SO<sub>2</sub>-。烷基羰基烷基：烷基-CO-烷基-。烷基磺酰基氧基：烷基-S(O)<sub>2</sub>-O-。卤代烷基磺酰基氧基：烷基磺酰基氧基的烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，例如 $CF_3-SO_2-O$ 。环烷基氧基羰基：如环丙氧基羰基、环己氧基羰基等。烷氧基：直链或支链烷基，经氧原子键连接到结构上。卤代烷氧基：直链或支链烷氧基，在这些烷氧基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。例如，氯甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、三氟乙氧基等。卤代烷氧基羰基：烷氧基羰基的烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，如 $ClCH_2CH_2OCO-$ 、 $CF_3CH_2OCO-$ 等。烷氧基烷基：烷基-O-烷基-，例如 $CH_3OCH_2-$ 。卤代烷氧基烷基：烷氧基烷基的烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，如 $ClCH_2CH_2OCH_2-$ 、 $CF_3CH_2OCH_2-$ 等。烷氧基羰基烷基：烷氧基羰基-烷基-，例如 $CH_3OCOCH_2-$ 。卤代烷氧基羰基烷基：烷氧基羰基烷基的烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，例如 $CF_3CH_2OCOCH_2-$ 。烷基羰基氧基：如 $CH_3COO-$ 等。卤代烷基羰基氧基：烷基羰基氧基的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，如 $CF_3COO-$ 等。烷氧基羰基氧基：烷氧基羰基-氧基-，例如 $CH_3OCOO-$ 。卤代烷氧基羰基氧基：烷氧基羰基氧基的烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，例如 $CF_3OCOO-$ 。烷硫基羰基烷基：烷硫基羰基-烷基-，例如 $CH_3SCOCH_2-$ 。卤代烷硫基羰基烷基：烷硫基羰基烷基的烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，例如 $CF_3CH_2SCOCH_2-$ 。烷氧基烷氧基：如 $CH_3OCH_2O-$ 等。卤代烷氧基烷氧基：烷氧基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，例如 $CF_3OCH_2O-$ 。烷氧基烷氧基羰基：如 $CH_3OCH_2CH_2OCO-$ 等。烷硫基：直链或支链烷基，经硫原子键连接到结构上。卤代烷硫基：直链或支链烷硫基，在这些烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。例如，氯甲硫基、二氯甲硫基、三氯甲硫基、氟甲硫基、二氟甲硫基、三氟甲硫基、氯氟甲硫基等。烷硫基烷基：烷基-S-烷基-，例如 $CH_3SCH_2-$ 。卤代烷硫基烷基：烷硫基烷基的烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代，如 $ClCH_2CH_2SCH_2-$ 、 $CF_3CH_2SCH_2-$ 等。烷基氨基：直链或支链烷基，经氮原子键连接到结构上。卤代烷基氨基：直链或支链烷基氨基，在这些烷基上的氢原子可部分或全部

被卤原子所取代。二烷基氨基:如 $(\text{CH}_3)_2\text{N}^-$ ,  $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{N}^-$ 。卤代二烷基氨基:烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代,如 $(\text{CF}_3)_2\text{N}^-$ ,  $(\text{CF}_3\text{CH}_2)_2\text{N}^-$ 。烯基:直链或支链烯类,例如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基和不同的丁烯基、戊烯基和己烯基异构体。烯基还包括多烯类,如1,2-丙二烯基和2,4-己二烯基。卤代烯基:直链或支链烯类,在这些烯基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。烯氧基:直链或支链烯类,经氧原子键连接到结构上。卤代烯氧基:直链或支链烯氧基,在这些烯氧基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。烯基硫基:直链或支链烯类,经硫原子键连接到结构上。如 $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{S}^-$ 。烯氧基羰基:如 $\text{CH}_2=\text{CHCH}_2\text{OCO}^-$ 等。炔基:直链或支链炔类,例如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基和不同的丁炔基、戊炔基和己炔基异构体。炔基还包括由多个三键组成的基团,如2,5-己二炔基。卤代炔基:直链或支链炔类,在这些炔基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。炔氧基:直链或支链炔类,经氧原子键连接到结构上。卤代炔氧基:直链或支链炔氧基,在这些炔氧基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。炔氧基羰基:如 $\text{CH}\equiv\text{CCH}_2\text{OCO}^-$ 等。烷基磺酰基:直链或支链烷基经磺酰基 $(-\text{SO}_2-)$ 连接到结构上,如甲基磺酰基。卤代烷基磺酰基:直链或支链烷基磺酰基,其烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代。烷基羰基:烷基经羰基连接到结构上,如 $\text{CH}_3\text{CO}^-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CO}^-$ 。卤代烷基羰基:烷基羰基的烷基上的氢原子可部分或全部被卤原子所取代,如 $\text{CF}_3\text{CO}^-$ 。烷氧基羰基:烷氧基经羰基连接到结构上。如 $\text{CH}_3\text{OCO}^-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCO}^-$ 。氨基羰基:如 $\text{NH}_2\text{CO}^-$ 。烷基氨基羰基:烷基 $-\text{NH}-\text{CO}^-$ ,例如 $\text{CH}_3\text{NHCO}^-$ ,  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHCO}^-$ 。二烷基氨基羰基:如 $(\text{CH}_3)_2\text{NCO}^-$ ,  $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NCO}^-$ 。(杂)芳基、(杂)芳基烷基、(杂)芳基羰基、(杂)芳甲基羰基、(杂)芳基羰基烷基、(杂)芳氧基羰基、(杂)芳基烷基氧基羰基中的芳基部分包括苯基或萘基等。杂芳基是含1个或多个N、O、S杂原子的五元环或六元环。例如咪喃基、吡唑基、噻唑基、吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、哒嗪基、三嗪基、喹啉基等。(杂)芳基:如苯基等。(杂)芳基烷基:如苯甲基、苯乙基、对氯苯甲基、2-氯吡啶-5-基、2-氯-噻唑-5-基等。(杂)芳基羰基:如苯甲酰基、4-氯苯甲酰基等。(杂)芳甲基羰基:如 $\text{PhCH}_2\text{CO}^-$ 。(杂)芳基羰基烷基:如 $\text{PhCOCH}_2^-$ 。(杂)芳氧基羰基:如苯氧基羰基、4-氯苯氧基羰基、4-硝基苯氧基羰基、萘氧基羰基等。芳基烷基氧基羰基:如苄基氧基羰基、4-氯苄基氧基羰基、4-三氟甲基苄基氧基羰基等。(杂)芳基烷基氧基羰基:如 $\text{PhCH}_2\text{OCO}^-$ 、4-Cl- $\text{PhCH}_2\text{OCO}^-$ 等。

[0079] 表1、表2、表3、表4、表5分别列举了通式I中 $\text{R}_1$ 、 $\text{R}_3$ 、 $\text{R}_4$ 和 $\text{R}_5$ 、 $\text{R}_6$ 和 $\text{R}_7$ 、Q的部分具体取代基,但它们并非仅限于这些取代基。



[0081] 表1  $\text{R}_1$ 取代基

[0082]

$\text{R}_8$	$\text{R}_8$	$\text{R}_8$	$\text{R}_8$
H	CN	$\text{CH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_5$
$n\text{-C}_3\text{H}_7$	$i\text{-C}_3\text{H}_7$	$n\text{-C}_4\text{H}_9$	$s\text{-C}_4\text{H}_9$
$i\text{-C}_4\text{H}_9$	$t\text{-C}_4\text{H}_9$	$\text{CF}_3$	$\text{CCl}_3$
$\text{CHF}_2$	$\text{CH}_2\text{F}$	$\text{CH}_2\text{Cl}$	$\text{CH}_2\text{CF}_3$

$\text{CF}_2\text{CF}_3$	$\text{COOCH}_3$	Ph	Ph-4-Cl
--------------------------	------------------	----	---------





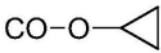
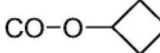
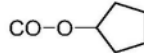
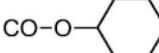
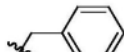
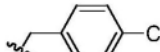
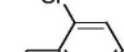
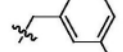

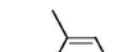
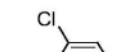
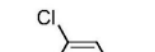
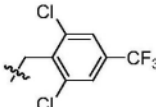
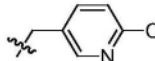
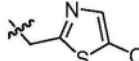
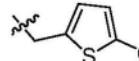
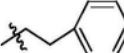
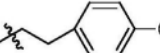
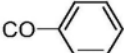




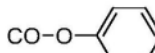
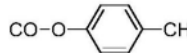
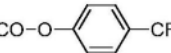
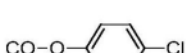
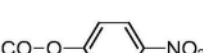
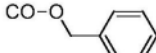
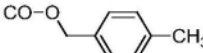
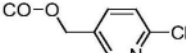
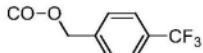
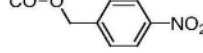
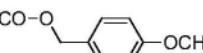
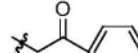
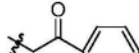
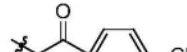
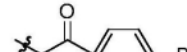
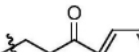
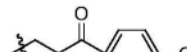
[0083] 表2  $\text{R}_3$ 取代基

[0084]

$\text{R}_3$	$\text{R}_3$	$\text{R}_3$	$\text{R}_3$
H	OH	$-\text{C}(=\text{O})\text{H}$	$\text{CBr}_3$
$\text{CH}_3$	$\text{C}_2\text{H}_5$	$n\text{-C}_3\text{H}_7$	$i\text{-C}_3\text{H}_7$
$n\text{-C}_4\text{H}_9$	$i\text{-C}_4\text{H}_9$	$t\text{-C}_4\text{H}_9$	$\text{CCl}_3$
$\text{CH}_2\text{Br}$	$\text{CHF}_2$	$\text{CHBr}_2$	$\text{CF}_3$
$\text{CH}_2\text{Cl}$	$\text{CHCl}_2$	$\text{CCl}_3$	$\text{CH}_2\text{F}$
$\text{OCH}_3$	$\text{OC}_2\text{H}_5$	$\text{OCH}(\text{CH}_3)_2$	$\text{OC}(\text{CH}_3)_3$
$\text{OCF}_3$	$\text{OCH}_2\text{CF}_3$	$\text{OCH}_2\text{F}$	$\text{OCHF}_2$
$\text{SCH}_3$	$\text{SC}_2\text{H}_5$	$\text{SCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	$\text{CH}=\text{CH}_2$
$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CCl}_2$	$\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$
$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C-I}$	$\text{CH}_2\text{OCH}_3$	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Cl}$	$\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{Cl}$
$\text{CH}_2\text{SCH}_3$	$\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_3$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_3$



[0085]

$\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{Cl}$	$\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{Cl}$	$\text{SOCH}_3$
$\text{SOC}_2\text{H}_5$	$\text{SOCF}_3$	$\text{SOCH}_2\text{CF}_3$	$\text{SO}_2\text{CH}_3$
$\text{SO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	$\text{SO}_2\text{CF}_3$	$\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$	$\text{SO}_2\text{NHCOCH}_3$
$\text{SO}_2\text{NHCH}_3$	$\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_3$	$\text{CONHSO}_2\text{CH}_3$	$\text{COCH}_3$
$\text{COC}_2\text{H}_5$	$\text{CO-}n\text{-C}_3\text{H}_7$	$\text{CO-}i\text{-C}_3\text{H}_7$	$\text{CO-}n\text{-C}_4\text{H}_9$
$\text{CO-}i\text{-C}_4\text{H}_9$	$\text{CO-}t\text{-C}_4\text{H}_9$	$\text{COCF}_3$	$\text{COCH}_2\text{Cl}$
$\text{COOCH}_3$	$\text{COOC}_2\text{H}_5$	$\text{COO-}n\text{-C}_3\text{H}_7$	$\text{COO-}t\text{-C}_4\text{H}_9$
$\text{COOCF}_3$	$\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	$\text{COOCH}_2\text{CF}_3$	$\text{CH}_2\text{COOCH}_3$
$\text{CH}_2\text{COOC}_2\text{H}_5$	$\text{CH}_2\text{COCH}_3$	$\text{CH}_2\text{COC}_2\text{H}_5$	$\text{CONHCH}_3$
$\text{CONHC}_2\text{H}_5$	$\text{CONH-}t\text{-C}_4\text{H}_9$	$\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	$\text{CON}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$
$\text{COOCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	$\text{COOCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{COOCH}_2\text{OCH}_3$	$\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
$\text{SNHCH}_3$	$\text{SNHC}_2\text{H}_5$	$\text{SN}(\text{CH}_3)_2$	$\text{SN}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$
			
			
			
			
			
			
			
			
			
			
			

[0086] 表3 R<sub>4</sub>(R<sub>5</sub>)取代基

[0087]

$R_4(R_5)$	$R_4(R_5)$	$R_4(R_5)$	$R_4(R_5)$
H	F	Cl	Br
I	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<i>n</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
<i>i</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	<i>n</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	<i>s</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	<i>i</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
<i>t</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CF <sub>3</sub>	CCl <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> Cl	CHBr <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )F
CH(CH <sub>3</sub> )Cl	CH(CH <sub>3</sub> )Br	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> F	OCH <sub>3</sub>
OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<i>n</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O	<i>i</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O	<i>n</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O
<i>s</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O	<i>i</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O	<i>t</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>			
<b>CR<sub>4</sub>R<sub>5</sub></b>			

[0088] 表4 R<sub>6</sub>(R<sub>7</sub>) 取代基

[0089]

$R_6(R_7)$	$R_6(R_7)$	$R_6(R_7)$	$R_6(R_7)$
H	F	Cl	Br
I	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<i>n</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
<i>i</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	<i>n</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	<i>s</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	<i>i</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
<i>t</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CF <sub>3</sub>	CCl <sub>3</sub>	CHF <sub>2</sub>
CH <sub>2</sub> Cl	CHBr <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub>	CH(CH <sub>3</sub> )F
CH(CH <sub>3</sub> )Cl	CH(CH <sub>3</sub> )Br	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> F	OCH <sub>3</sub>
OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<i>n</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O	<i>i</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> O	<i>n</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O
<i>s</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O	<i>i</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O	<i>t</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> O	OCF <sub>3</sub>
OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>			
<b>CR<sub>6</sub>R<sub>7</sub></b>			

[0090] 表5 Q取代基

[0091]

Q1		Q15		Q29		Q43	
Q2		Q16		Q30		Q44	

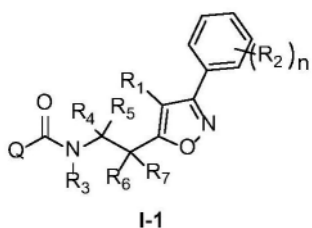
[0092]

Q3		Q17		Q31		Q45	
Q4		Q18		Q32		Q46	
Q5		Q19		Q33		Q47	
Q6		Q20		Q34		Q48	
Q7		Q21		Q35		Q49	
Q8		Q22		Q36		Q50	
Q9		Q23		Q37		Q51	
Q10		Q24		Q38		Q52	
Q11		Q25		Q39		Q53	
Q12		Q26		Q40		Q54	
Q13		Q27		Q41		Q55	
Q14		Q28		Q42			

[0093] 本发明的部分化合物可以用表6—表34中列出的具体化合物来说明,但并不限定本发明。表中涉及的通式化合物I中,  $R_1=R_3=R_4=R_5=R_6=R_7=H$ 。

[0094] 通式I中,当五元环为双键时,通式结构如下:

[0095]



[0096] 通式I-1中,当 $Q=Q1$ 时,  $(R_2)_n$  取代基见表6,代表化合物编号依次为6-1—6-288。

[0097] 表6

No.	(R <sub>2</sub> ) <sub>n</sub>	No.	(R <sub>2</sub> ) <sub>n</sub>	No.	(R <sub>2</sub> ) <sub>n</sub>
6-1	H	6-2	2-F	6-3	3-F
6-4	4-F	6-5	2,3-diF	6-6	2,4-diF
6-7	2,6-diF	6-8	2,6-diF	6-9	3,4-diF
6-10	3,6-diF	6-11	2,3,4-triF	6-12	2,3,6-triF
6-13	2,4,6-triF	6-14	2,3,6-triF	6-15	2,4,6-triF
6-16	3,4,6-triF	6-17	2-Cl	6-18	3-Cl
6-19	4-Cl	6-20	2,3-diCl	6-21	2,4-diCl
6-22	2,6-diCl	6-23	2,6-diCl	6-24	3,4-diCl
6-25	3,6-diCl	6-26	2,3,4-triCl	6-27	2,3,6-triCl
6-28	2,4,6-triCl	6-29	2,3,6-triCl	6-30	2,4,6-triCl
6-31	3,4,6-triCl	6-32	2-Br	6-33	3-Br
6-34	4-Br	6-35	2,3-diBr	6-36	2,4-diBr
6-37	2,6-diBr	6-38	2,6-diBr	6-39	3,4-diBr
6-40	3,6-diBr	6-41	2,3,4-triBr	6-42	2,3,6-triBr
6-43	2,4,6-triBr	6-44	2,3,6-triBr	6-45	2,4,6-triBr
6-46	3,4,6-triBr	6-47	2-CN	6-48	3-CN
[0098] 6-49	4-CN	6-50	2-NO <sub>2</sub>	6-51	3-NO <sub>2</sub>
6-52	4-NO <sub>2</sub>	6-53	2,4-diNO <sub>2</sub>	6-54	2,4,6-3NO <sub>2</sub>
6-55	2-CH <sub>3</sub>	6-56	3-CH <sub>3</sub>	6-57	4-CH <sub>3</sub>
6-58	2,3-diCH <sub>3</sub>	6-59	2,4-diCH <sub>3</sub>	6-60	2,5-diCH <sub>3</sub>
6-61	2,6-diCH <sub>3</sub>	6-62	3,4-diCH <sub>3</sub>	6-63	3,6-diCH <sub>3</sub>
6-64	2-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-65	3-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-66	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
6-67	2-CF <sub>3</sub>	6-68	3-CF <sub>3</sub>	6-69	4-CF <sub>3</sub>
6-70	2-OCH <sub>3</sub>	6-71	3-OCH <sub>3</sub>	6-72	4-OCH <sub>3</sub>
6-73	2-SCH <sub>3</sub>	6-74	3-SCH <sub>3</sub>	6-75	4-SCH <sub>3</sub>
6-76	2-OCF <sub>3</sub>	6-77	3-OCF <sub>3</sub>	6-78	4-OCF <sub>3</sub>
6-79	2-SCF <sub>3</sub>	6-80	3-SCF <sub>3</sub>	6-81	4-SCF <sub>3</sub>
6-82	2-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-83	3-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-84	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
6-85	2-NHCH <sub>3</sub>	6-86	3-NHCH <sub>3</sub>	6-87	4-NHCH <sub>3</sub>
6-88	2-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	6-89	3-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	6-90	4-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
6-91	2-COCH <sub>3</sub>	6-92	3-COCH <sub>3</sub>	6-93	4-COCH <sub>3</sub>
6-94	2-COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-95	3-COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-96	4-COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
6-97	2-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-98	3-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-99	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
6-100	2-OCHF <sub>2</sub>	6-101	3-OCHF <sub>2</sub>	6-102	4-OCHF <sub>2</sub>

[0099]

6-103	2-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-104	3-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-105	4-SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
6-106	2-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-107	3-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-108	4-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
6-109	2-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-110	3-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-111	4-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
6-112	2-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	6-113	3-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	6-114	4-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
6-115	2-OCOCH <sub>3</sub>	6-116	3-OCOCH <sub>3</sub>	6-117	4-OCOCH <sub>3</sub>
6-118	2-OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-119	3-OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-120	4-OCOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
6-121	2-OCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-122	3-OCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-123	4-OCO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
6-124	2-OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	6-125	3-OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	6-126	4-OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
6-127	2-OCF <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	6-128	3-OCF <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	6-129	4-OCF <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>
6-130	2-COPh	6-131	3-COPh	6-132	4-COPh
6-133	2-COCH <sub>2</sub> Ph	6-134	3-COCH <sub>2</sub> Ph	6-135	4-COCH <sub>2</sub> Ph
6-136	2-NHPPh	6-137	3-NHPPh	6-138	4-NHPPh
6-139	2-OPh	6-140	3-OPh	6-141	4-OPh
6-142	2-CONHPPh	6-143	3-CONHPPh	6-144	4-CONHPPh
6-145	2-CO <sub>2</sub> Ph	6-146	3-CO <sub>2</sub> Ph	6-147	4-CO <sub>2</sub> Ph
6-148	2-CONH <sub>2</sub>	6-149	3-CONH <sub>2</sub>	6-150	4-CONH <sub>2</sub>
6-151	2-Cl-4-F	6-152	2-Cl-4-Br	6-153	2-Cl-4-CH <sub>3</sub>
6-154	2-Cl-4-CF <sub>3</sub>	6-155	2-Cl-4-NO <sub>2</sub>	6-156	2-Cl-4-CN
6-157	2-Cl-4-OCF <sub>3</sub>	6-158	2-F-4-Cl	6-159	2-Br-4-Cl
6-160	2-CH <sub>3</sub> -4-Cl	6-161	2-CF <sub>3</sub> -4-Cl	6-162	2-NO <sub>2</sub> -4-Cl
6-163	2-CN-4-Cl	6-164	2-OCF <sub>3</sub> -4-Cl	6-165	2,6-diCl-4-NO <sub>2</sub>
6-166	2,6-diCl-4-CF <sub>3</sub>	6-167	2,6-diCl-4-CN	6-168	2,6-diCl-4-COCH <sub>3</sub>
6-169	2,6-diCl-4-CONH <sub>2</sub>	6-170	2,4-diCl-6-NO <sub>2</sub>	6-171	2,4-diCl-6-CN
6-172	2,4-diCl-6-CF <sub>3</sub>	6-173	2,4-diF-6-NO <sub>2</sub>	6-174	2,6-diF-4-NO <sub>2</sub>
6-175	2-NO <sub>2</sub> -4-F	6-176	2-NO <sub>2</sub> -4-Br	6-177	2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>
6-178	2-NO <sub>2</sub> -4-CN	6-179	2-NO <sub>2</sub> -4-COCH <sub>3</sub>	6-180	2-NO <sub>2</sub> -4-CONH <sub>2</sub>
6-181	2-NO <sub>2</sub> -4-CH <sub>3</sub>	6-182	2-NO <sub>2</sub> -4-OCH <sub>3</sub>	6-183	2-NO <sub>2</sub> -4-SCH <sub>3</sub>
6-184	2-NO <sub>2</sub> -4-NHCH <sub>3</sub>	6-185	2-F-4-NO <sub>2</sub>	6-186	2-Br-4-NO <sub>2</sub>
6-187	2-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>	6-188	2-CN-4-NO <sub>2</sub>	6-189	2-COCH <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>
6-190	2-CONH <sub>2</sub> -4-NO <sub>2</sub>	6-191	2-CH <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>	6-192	2-Cl-4-F-6-NO <sub>2</sub>
6-193	2-Cl-4-Br-6-NO <sub>2</sub>	6-194	2-Cl-4-CH <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>	6-195	2-Cl-4-CF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>
6-196	2-Cl-4,6-diNO <sub>2</sub>	6-197	2-Cl-4-CN-6-NO <sub>2</sub>	6-198	2-Cl-4-OCF <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>
6-199	2-F-4-Cl-6-NO <sub>2</sub>	6-200	2-Br-4-Cl-6-NO <sub>2</sub>	6-201	2-CH <sub>3</sub> -4-Cl-6-NO <sub>2</sub>
6-202	2-CF <sub>3</sub> -4-Cl-6-NO <sub>2</sub>	6-203	4-Cl-2,6-diNO <sub>2</sub>	6-204	2-CF <sub>3</sub> -4-CN
6-205	2-CN-4-CF <sub>3</sub>	6-206	4-CF <sub>3</sub> -2,6-diNO <sub>2</sub>	6-207	4-CN-2,6-diNO <sub>2</sub>
6-208	4-CH <sub>3</sub> -2,6-diNO <sub>2</sub>	6-209	4-OCF <sub>3</sub> -2,6-diNO <sub>2</sub>	6-210	4-OCH <sub>3</sub> -2,6-diNO <sub>2</sub>
6-211	4-SCH <sub>3</sub> -2,6-diNO <sub>2</sub>	6-212	4-NHCH <sub>3</sub> -2,6-diNO <sub>2</sub>	6-213	4-F-2,6-diNO <sub>2</sub>
6-214	2-CF <sub>3</sub> -4,6-diNO <sub>2</sub>	6-215	2-CN-4,6-diNO <sub>2</sub>	6-216	2-CH <sub>3</sub> -4,6-diNO <sub>2</sub>
6-217	2-F-4,6-diNO <sub>2</sub>	6-218	2-OCF <sub>3</sub> -4,6-diNO <sub>2</sub>	6-219	2-CF <sub>3</sub> -4-Br
6-220	3-CF <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>	6-221	2-CN-4-Cl-6-NO <sub>2</sub>	6-222	2-OCF <sub>3</sub> -4-Cl-6-NO <sub>2</sub>
6-223	3-CF <sub>3</sub> -4-CN	6-224	3-CN-4-CF <sub>3</sub>	6-225	2-CF <sub>3</sub> -4-Br-6-NO <sub>2</sub>
6-226	3-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub>	6-227	2-NO <sub>2</sub> -4-CN-6-CF <sub>3</sub>	6-228	2-NO <sub>2</sub> -4-CF <sub>3</sub> -6-CN
6-229	4-OCF <sub>3</sub> -2,6-diBr	6-230	2-CH <sub>3</sub> -4-Cl-6-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	6-231	2,4-diCl-3-CH <sub>3</sub>

6-232	2,4-diCl-3-CH <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>	6-233	2-Cl-3-CH <sub>3</sub>	6-234	2-CH <sub>3</sub> -3-Cl	
6-235	2-CH <sub>3</sub> -3-Cl-4,6-diNO <sub>2</sub>	6-236	2-CH <sub>3</sub> -3-Cl-4-NO <sub>2</sub>	6-237	2-CH <sub>3</sub> -3-Cl-6-NO <sub>2</sub>	
6-238	2-Cl-3-CH <sub>3</sub> -4,6-diNO <sub>2</sub>	6-239	2-Cl-3-CH <sub>3</sub> -4-NO <sub>2</sub>	6-240	2-Cl-3-CH <sub>3</sub> -6-NO <sub>2</sub>	
6-241	2-Br-4-NO <sub>2</sub> -6-CN	6-242	3-Cl-4-CF <sub>3</sub> -2,6-diNO <sub>2</sub>	6-243	2-NO <sub>2</sub> -4,6-diCl	
6-244	2-NO <sub>2</sub> -3,6-diCl	6-245	2,6-diCl-4-NO <sub>2</sub>	6-246	2,6-diCl-6-NO <sub>2</sub>	
6-247	2,3-diCl-4-NO <sub>2</sub>	6-248	2,3-diCl-6-NO <sub>2</sub>	6-249	3,4-diCl-2,6-diNO <sub>2</sub>	
6-250	2,6-diCl-4,6-diNO <sub>2</sub>	6-251	2,4,6-triCl-6-NO <sub>2</sub>	6-252	2,3,4-triCl-6-NO <sub>2</sub>	
6-253	2,3,4-triCl-6-NO <sub>2</sub>	6-254	2,3,6-triCl-4,6-diCN	6-255	2,6-diCl-4-OCF <sub>2</sub> OCF <sub>3</sub>	
6-256	2,6-diBr-4-NO <sub>2</sub>	6-257	2-F-4-NO <sub>2</sub> -6-Cl	6-258	2-Cl-4-NO <sub>2</sub> -6-SCN	
[0100]	6-259	2-Br-4-NO <sub>2</sub> -6-Cl	6-260	2-Cl-4-NO <sub>2</sub> -6-OCH <sub>3</sub>	6-261	2-Cl-4-NO <sub>2</sub> -6-SCH <sub>3</sub>
	6-262	2-Cl-4-NO <sub>2</sub> -6-NHCH <sub>3</sub>	6-263	2-Cl-4-NO <sub>2</sub> -6-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-264	2-Cl-4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	6-265	2,6-diCl-4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	6-266	2,6-diCl-4-CH <sub>3</sub>	6-267	2,6-diCl-4-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
	6-268	2,6-diCl-4-CONHCH <sub>3</sub>	6-269	2,6-diCl-4-CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	6-270	2,6-diCl-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>
	6-271	2-Cl-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -6-Br	6-272	2-F-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -6-Br	6-273	2-F-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -6-Cl
	6-274	2,6-diF-4-CF(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -6-Cl	6-275	2,4,6-triCl-3,6-2CN	6-276	2,3,6-triF-4,6-diCN
	6-277	2-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	6-278	3-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	6-279	4-SO <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>
	6-280	2- <i>i</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	6-281	3- <i>i</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	6-282	4- <i>i</i> -C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	6-283	2- <i>n</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	6-284	3- <i>n</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	6-285	4- <i>n</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
	6-286	2- <i>t</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	6-287	3- <i>t</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	6-288	4- <i>t</i> -C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>

[0101] 表7:通式I-1中,当Q=Q2时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为7-1-7-288。

[0102] 表8:通式I-1中,当Q=Q3时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为8-1-8-288。

[0103] 表9:通式I-1中,当Q=Q4时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为9-1-9-288。

[0104] 表10:通式I-1中,当Q=Q5时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为10-1-10-288。

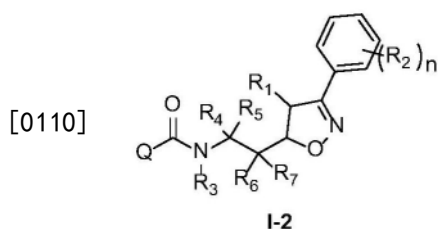
[0105] 表11:通式I-1中,当Q=Q6时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为11-1-11-288。

[0106] 表12:通式I-1中,当Q=Q7时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为12-1-12-288。

[0107] 表13:通式I-1中,当Q=Q8时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为13-1-13-288。

[0108] 表14:通式I-1中,当Q=Q9时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为14-1-14-288。

[0109] 通式I中,当五元环为单键时,通式结构如下:



[0111] 表15:通式I-2中,当Q=Q1时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为15-1-15-288。

[0112] 表16:通式I-2中,当Q=Q2时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为16-1-16-288。

[0113] 表17:通式I-2中,当Q=Q3时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为17-1-17-288。

[0114] 表18:通式I-2中,当Q=Q4时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为18-1-18-288。

[0115] 表19:通式I-2中,当Q=Q5时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为19-1-19-288。

[0116] 表20:通式I-2中,当Q=Q6时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为20-1-20-288。

[0117] 表21:通式I-2中,当Q=Q7时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为21-1-21-288。

[0118] 表22:通式I-2中,当Q=Q8时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为22-1-22-288。

[0119] 表23:通式I-2中,当Q=Q9时,取代基(R<sub>2</sub>)<sub>n</sub>与表6所示取代基一致,取代基依次对应表6的6-1-6-288,代表化合物编号依次为23-1-23-288。

[0120] 通式I-1中,当Q=Q1时,取代基R<sub>3</sub>(不为氢时)为不同的取代基见表24,代表化合物编号依次为24-1-24-140。

[0121] 表24

[0122]

No.	R <sub>3</sub>	No.	R <sub>3</sub>	No.	R <sub>3</sub>	No.	R <sub>3</sub>
24-1	S-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	24-2	OH	24-3	-C(=O)H	24-4	CBr <sub>3</sub>
24-5	CH <sub>3</sub>	24-6	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	24-7	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	24-8	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
24-9	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	24-10	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	24-11	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	24-12	Cl <sub>3</sub>
24-13	CH <sub>2</sub> Br	24-14	CHF <sub>2</sub>	24-15	CHBr <sub>2</sub>	24-16	CF <sub>3</sub>
24-17	CH <sub>2</sub> Cl	24-18	CHCl <sub>2</sub>	24-19	CCl <sub>3</sub>	24-20	CH <sub>2</sub> F
24-21	OCH <sub>3</sub>	24-22	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	24-23	OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	24-24	OC(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>
24-25	OCF <sub>3</sub>	24-26	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	24-27	OCH <sub>2</sub> F	24-28	OCHF <sub>2</sub>
24-29	SCH <sub>3</sub>	24-30	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	24-31	SCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	24-32	CH=CH <sub>2</sub>
24-33	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	24-34	CH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub>	24-35	C≡CH	24-36	CH <sub>2</sub> C≡CH
24-37	CH <sub>2</sub> C≡C-I	24-38	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	24-39	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	24-40	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>
24-41	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	24-42	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> Cl	24-43	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	24-44	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> Cl
24-45	CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	24-46	CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	24-47	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	24-48	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
24-49	CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Cl	24-50	CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	24-51	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> Cl	24-52	SOCH <sub>3</sub>
24-53	SOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	24-54	SOCF <sub>3</sub>	24-55	SOCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	24-56	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
24-57	SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	24-58	SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	24-59	SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	24-60	SO <sub>2</sub> NHCOCH <sub>3</sub>

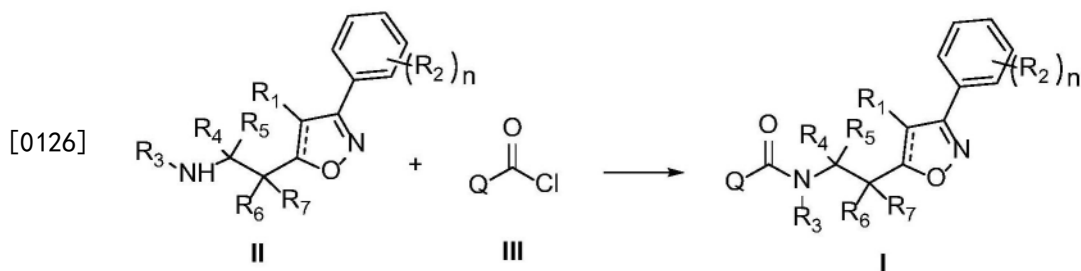
[0123]

24-61	$\text{SO}_2\text{NHCH}_3$	24-62	$\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_3$	24-63	$\text{CONHSO}_2\text{CH}_3$	24-64	$\text{COCH}_3$
24-65	$\text{COC}_2\text{H}_5$	24-66	$\text{CO-n-C}_3\text{H}_7$	24-67	$\text{CO-i-C}_3\text{H}_7$	24-68	$\text{CO-n-C}_4\text{H}_9$
24-69	$\text{CO-i-C}_4\text{H}_9$	24-70	$\text{CO-t-C}_4\text{H}_9$	24-71	$\text{COCF}_3$	24-72	$\text{COCH}_2\text{Cl}$
24-73	$\text{COOCH}_3$	24-74	$\text{COOC}_2\text{H}_5$	24-75	$\text{COO-n-C}_3\text{H}_7$	24-76	$\text{COO-t-C}_4\text{H}_9$
24-77	$\text{COOCF}_3$	24-78	$\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	24-79	$\text{COOCH}_2\text{CF}_3$	24-80	$\text{CH}_2\text{COOCH}_3$
24-81	$\text{CH}_2\text{COOC}_2\text{H}_5$	24-82	$\text{CH}_2\text{COCH}_3$	24-83	$\text{CH}_2\text{COC}_2\text{H}_5$	24-84	$\text{CONHCH}_3$
24-85	$\text{CONHC}_2\text{H}_5$	24-86	$\text{CONH-t-C}_4\text{H}_9$	24-87	$\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	24-88	$\text{CON}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$
24-89	$\text{COOCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	24-90	$\text{COOCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	24-91	$\text{COOCH}_2\text{OCH}_3$	24-92	$\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
24-93	$\text{SNHCH}_3$	24-94	$\text{SNHC}_2\text{H}_5$	24-95	$\text{SN}(\text{CH}_3)_2$	24-96	$\text{SN}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$
24-97		24-98		24-99		24-100	
24-101	$\text{CO-O-}$	24-102	$\text{CO-O-}$	24-103	$\text{CO-O-}$	24-104	$\text{CO-O-}$
24-105		24-106		24-107		24-108	
24-109		24-110		24-111		24-112	
24-113		24-114		24-115		24-116	
24-117		24-118		24-119	$\text{CO-}$	24-120	$\text{CO-}$
24-121	$\text{CO-}$	24-122	$\text{CO-}$	24-123	$\text{CO-}$	24-124	$\text{CO-O-}$
24-125	$\text{CO-O-}$	24-126	$\text{CO-O-}$	24-127	$\text{CO-O-}$	24-128	$\text{CO-O-}$
24-129	$\text{CO-O-}$	24-130	$\text{CO-O-}$	24-131	$\text{CO-O-}$	24-132	$\text{CO-O-}$
24-133	$\text{CO-O-}$	24-134	$\text{CO-O-}$	24-135		24-136	
24-137		24-138		24-139		24-140	

[0124] 本发明化合物按照以下方法制备,反应式如下,式中各基团除另有说明外定义同前:

[0125] 通式I化合物的制备采用如下方法:





[0127] 中间体II和III在碱性条件下于适宜的溶剂中反应得到通式I化合物。

[0128] 适宜的碱可选自如三乙胺、氢氧化钾、氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠、吡啶、甲醇钠、乙醇钠、氢化钠、叔丁醇钾或叔丁醇钠等。

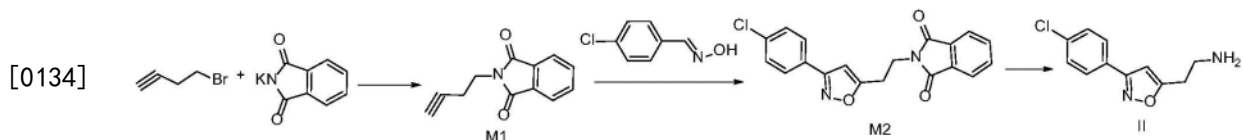
[0129] 反应在适宜的溶剂中进行,适宜的溶剂可选自如二氯甲烷、四氢呋喃、1,4-二氧六环、乙腈、甲苯、二甲苯、苯、N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、二甲亚砜、丙酮或丁酮等。

[0130] 反应温度可在室温至溶剂沸点温度之间,通常为20-100℃。

[0131] 反应时间为30分钟至20小时,通常1-10小时。

[0132] 中间体III部分有市售,也可以按公知方法制备,如CN108947892、Journal of Medicinal Chemistry,46 (23),4895-4903;2003等。

[0133] 中间体II是制备本发明通式I化合物的关键中间体,按以下方法制备:



[0135] 4-溴丁炔与邻苯二甲酰亚胺钾盐在适宜的温度下,在适宜的溶剂中反应30分钟至20小时,通常1-10小时,制得中间体M1,此步骤操作方法参照W02002028395和Organic Letters,7 (4),733-736;2005;4-氯苯甲醛肟氯化后与M1在碱性条件下于适宜的溶剂中反应得到M2,此步骤操作方法参照W02006065280和Chemical Communications (Cambridge, United Kingdom),47 (11),3198-3200;2011;M2在碱性条件下于适宜的溶剂中脱氨基保护得到II,此步骤操作方法参照European Journal of Organic Chemistry,2013 (23),5143-5148;2013和W02016011209等。

[0136] 虽然本发明的通式I化合物与现有技术中公开的某些化合物也属于取代异噁唑乙胺类化合物,但结构特征仍存在显著不同。并且由于这些结构上的差异而使得本发明的化合物具有更好的杀菌活性。

[0137] 通式I化合物对农业或其他领域中的多种病菌显示出优异的活性,因此,本发明的技术方案还包括通式I化合物在农业或其他领域中用作制备杀菌剂的用途。

[0138] 下面提及的病害的例子仅用来说明本发明,但绝不限定本发明。

[0139] 通式I化合物可用于防治下列病害:卵菌纲病害,如霜霉病(黄瓜霜霉病、油菜霜霉病、大豆霜霉病、甜菜霜霉病、甘蔗霜霉病、烟草霜霉病、豌豆霜霉病、丝瓜霜霉病、冬瓜霜霉病、甜瓜霜霉病、白菜类霜霉病、菠菜霜霉病、萝卜霜霉病、葡萄霜霉病、葱霜霉病),白锈菌(油菜白锈病、白菜类白锈病),猝倒病(油菜猝倒病、烟草猝倒病、番茄猝倒病、辣椒猝倒病、茄子猝倒病、黄瓜猝倒病、棉苗猝倒病),绵腐病(辣椒绵腐病、丝瓜绵腐病、冬瓜绵腐病),疫病(蚕豆疫病、黄瓜疫病、南瓜疫病、冬瓜疫病、西瓜疫病、甜瓜疫病、辣椒疫病、韭菜疫病、大蒜疫病、棉花疫病),晚疫病(马铃薯晚疫病、番茄晚疫病)等;半知菌病害,如枯萎病(甘薯枯

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

[0140] 由于其积极的特性,上述化合物可有利地用于保护农业和园艺业重要的作物、家畜和种畜,以及人类常去的环境免于病菌、害虫害螨的伤害。

[0141] 为获得理想效果,化合物的用量因各种因素而改变,例如所用化合物、预保护的作物、有害生物的类型、感染程度、气候条件、施药方法、采用的剂型。

[0142] 每公顷10克—5公斤的化合物剂量能提供充分的防治。

[0143] 本发明的技术方案还包括防治病菌、害虫害螨的方法:将本发明的杀菌、杀虫杀螨化合物施于所述的病菌或其生长介质上。通常选择的较为适宜有效量为每公顷10克到1000克,优选有效量为每公顷20克到500克。

[0144] 对于某些应用,例如在农业上可在本发明的杀菌、杀虫杀螨组合中加入一种或多种其它的杀菌剂、杀虫杀螨剂、除草剂、植物生长调节剂或肥料等,由此可产生附加的优点和效果。

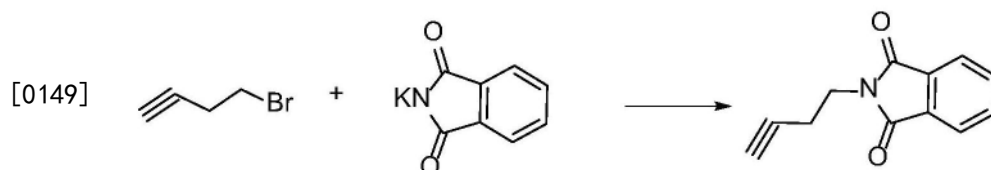
### 具体实施方式

[0145] 以下具体实施例用来进一步说明本发明,但本发明绝非仅限于这些例子(除另有注明外,所用原料均有市售)。

[0146] 合成实施例

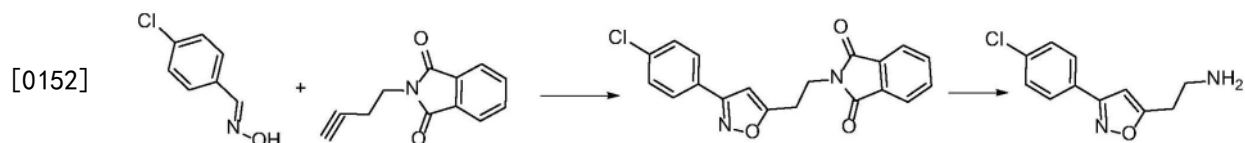
[0147] 实例1:中间体2-(3-(4-对氯苯基)异噁唑-5-基)-1-乙胺的制备

[0148] 1) N-(3-丁炔)邻苯二甲酰亚胺的制备



[0150] 室温搅拌下将13.30g (0.10mol) 4-溴丁炔和18.5g (0.1mol) 邻苯二甲酰亚胺钾盐投入到100ml N,N-二甲基甲酰胺溶剂中,60℃搅拌反应5-7小时后,向反应液中加50-100ml水,抽滤水洗得白色固体18.3g,收率92%。

[0151] 2) 2-(3-(4-对氯苯基)异噁唑-5-基)-1-乙胺的制备

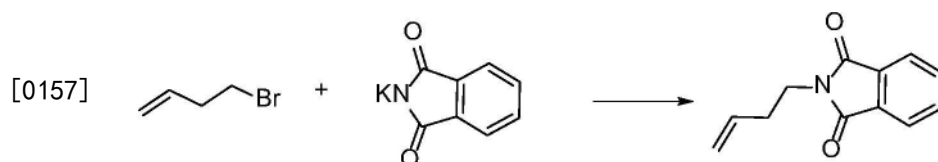


[0153] 将15.5g (0.1mol) 4-氯苯甲醛肟溶于50ml N,N-二甲基甲酰胺溶液中,搅拌下向反应瓶中分批加入14.7g (0.11mol) NCS,50℃反应3-4小时,TLC监测4-氯苯甲醛肟完全反应后,加入19.9g (0.1mol) N-(3-丁炔)邻苯二甲酰亚胺和8.4g (0.1mol) 碳酸氢钠,继续反应4小时,TLC监测反应完毕后,冷却后将反应液倒入水中搅拌30min,过滤并用水洗涤得白色固体13.2g,收率37.4%。

[0154] 将上述得到白色固体溶于300ml THF和60ml DCM中,加入9.4g水合肼,50℃反应3-4小时,TLC监测N-(2-(3-(4-氯苯基)异噁唑-5-基)乙基)邻苯二甲酰亚胺完全反应后,冷却,过滤,滤液减压浓缩后,加入DCM溶解,有机相用氢氧化钠溶液洗涤,无水硫酸镁干燥,得到淡黄色固体2-(3-(4-氯苯基)异噁唑-5-基)-1-乙胺7.3g,收率87.6%。

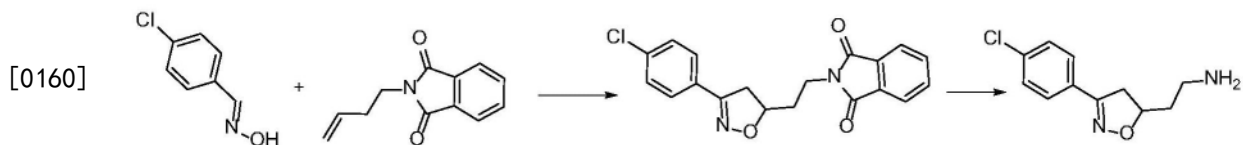
[0155] 实施例2:中间体的制备

[0156] 1) N-(3-丁烯)邻苯二甲酰亚胺的制备



[0158] 室温搅拌下将13.50g (0.10mol) 4-溴丁烯和18.5g (0.1mol) 邻苯二甲酰亚胺钾盐投入到100ml N,N-二甲基甲酰胺溶剂中,60℃搅拌反应5-7小时后,向反应液中加50-100ml水,抽滤水洗得白色固体17.6g,收率87.6%。

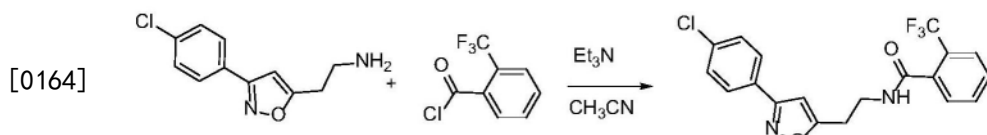
[0159] 2) 2-(3-(4-氯苯基)异噁唑-5-基)-1-乙胺的制备



[0161] 将15.5g (0.1mol) 4-氯苯甲醛肟溶于50ml N,N-二甲基甲酰胺溶液中,搅拌下向反应瓶中分批加入14.7g (0.11mol) NCS, 50℃反应3-4小时, TLC监测4-氯苯甲醛肟完全反应后,加入20.1g (0.1mol) N-(3-丁炔)邻苯二甲酰亚胺和8.4g (0.1mol) 碳酸氢钠,继续反应4小时, TLC监测反应完毕后,冷却后将反应液倒入水中搅拌30min,过滤并用水洗涤得白色固体14.3g,收率40.3%。

[0162] 将上述得到白色固体溶于300ml THF和60ml DCM中,加入10g水合肼, 50℃反应3-4小时, TLC监测N-(2-(3-(4-氯苯基)异噁唑-5-基)乙基)邻苯二甲酰亚胺完全反应后,冷却,过滤,滤液减压浓缩后,加入DCM溶解,有机相用氢氧化钠溶液洗涤,无水硫酸镁干燥,得到淡黄色固体2-(3-(4-氯苯基)异噁唑-5-基)-1-乙胺6.9g,收率76.2%。

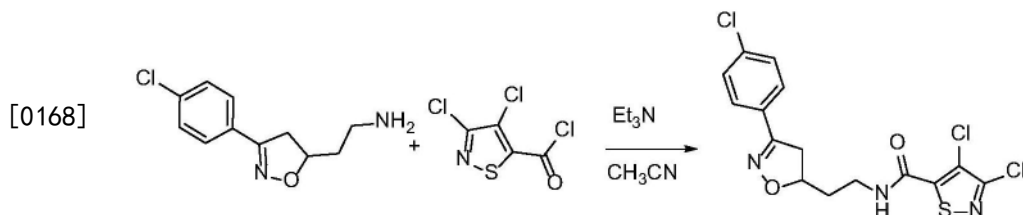
[0163] 实施例3:化合物6-19的制备



[0165] 将0.22g (10mmol) 2-(3-(4-氯苯基)异噁唑-5-基)-1-乙胺溶于20ml乙腈溶剂中,搅拌下向反应瓶中滴入溶于5ml乙腈的0.23g (11mmol) 邻三氟甲基苯甲酰氯,室温反应3-4小时, TLC监测完全反应后,减压蒸除溶剂,加入(3×50ml)乙酸乙酯萃取,有机相用饱和食盐水50ml洗涤,脱溶后残余物柱层析得黄色油状物0.24g,收率60.8%。

[0166]  $^1\text{H-NMR}$  (600MHz, 内标TMS, 溶剂 $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm) : 7.69 (m, 3H) , 7.54 (m, 2H) , 7.50 (m, 1H) , 7.42 (m, 2H) , 6.41 (s, 1H) , 6.15 (s, 1H) , 3.85 (m, 2H) , 3.17 (m, 2H) .

[0167] 实施例4:化合物16-19的制备



[0169] 将0.22g (10mmol) 2-(3-(4-氯苯基)异噁唑-5-基)-1-乙胺溶于20ml乙腈溶剂中,搅拌下向反应瓶中滴入溶于5ml乙腈的0.24g (11mmol) 邻三氟甲基苯甲酰氯,室温反应3-4小时, TLC监测完全反应后,减压蒸除溶剂,加入(3×50ml)乙酸乙酯萃取,有机相用饱和食盐水50ml洗涤,脱溶后残余物柱层析得白色固体0.20g,收率49.4%。

[0170]  $^1\text{H-NMR}$  (600MHz, 内标TMS, 溶剂 $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  (ppm) :  $\delta$  ( $\text{CDCl}_3$ ) : 7.61 (m, 2H) , 7.50 (s, 1H) , 7.40 (m, 2H) , 4.92 (m, 1H) , 3.82 (m, 1H) , 3.62 (m, 1H) , 3.55 (m, 1H) , 3.05 (m, 1H) , 2.05 (m, 2H) .

[0171] 本发明的其他化合物可以参照以上实施例制备。

[0172] 部分化合物的物性数据及核磁数据( $^1\text{H-NMR}$ , 600MHz, 内标TMS, ppm)如下:

[0173] 化合物6-1: oil.  $\delta$  ( $\text{CDCl}_3$ ) : 7.74 (m, 2H) , 7.68 (m, 1H) , 7.54 (m, 3H) , 7.43 (m, 3H) ,

- 6.42 (s, 1H), 6.24 (s, 1H), 3.85 (m, 2H), 3.17 (m, 2H) .
- [0174] 化合物6-4:oil。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.79 (m, 2H), 7.68 (m, 1H), 7.57 (m, 2H), 7.52 (m, 1H), 7.28 (m, 2H), 6.42 (s, 1H), 6.16 (s, 1H), 3.85 (m, 2H), 3.18 (m, 2H) .
- [0175] 化合物6-17:熔点96.0℃。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.70 (m, 2H), 7.58 (m, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.48 (m, 1H), 7.39 (m, 1H), 7.34 (m, 1H), 6.59 (s, 1H), 6.09 (s, 1H), 3.87 (m, 2H), 3.21 (m, 2H) .
- [0176] 化合物6-21:oil。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.70 (m, 1H), 7.66 (m, 1H), 7.59 (m, 2H), 7.54 (m, 2H), 7.34 (m, 1H), 6.59 (s, 1H), 6.08 (s, 1H), 3.87 (m, 2H), 3.21 (m, 2H) .
- [0177] 化合物6-49:oil。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.90 (m, 2H), 7.75 (m, 2H), 7.70 (m, 1H), 7.55 (m, 2H), 7.25 (m, 1H), 6.50 (s, 1H), 6.07 (s, 1H), 3.88 (m, 2H), 3.21 (m, 2H) .
- [0178] 化合物6-57:oil。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.67 (m, 1H), 7.62 (m, 2H), 7.47 (m, 2H), 7.45 (m, 1H), 7.22 (m, 2H), 6.38 (s, 1H), 6.28 (s, 1H), 3.83 (m, 2H), 3.13 (m, 2H), 2.38 (s, 3H) .
- [0179] 化合物6-55:熔点90.8℃。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.69 (m, 1H), 7.57 (m, 1H), 7.52 (m, 2H), 7.45 (m, 1H), 7.33 (m, 1H), 7.26 (m, 2H), 6.30 (s, 1H), 6.16 (s, 1H), 3.86 (m, 2H), 3.18 (m, 2H), 2.45 (s, 3H) .
- [0180] 化合物6-60:oil。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.70 (m, 1H), 7.58 (m, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.29 (s, 1H), 7.16 (m, 2H), 6.29 (s, 1H), 6.15 (s, 1H), 3.86 (m, 2H), 3.18 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.34 (s, 3H) .
- [0181] 化合物6-69:熔点153.9℃。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.90 (m, 2H), 7.70 (m, 3H), 7.59 (m, 1H), 7.52 (m, 2H), 6.49 (s, 1H), 6.08 (s, 1H), 3.88 (m, 2H), 3.21 (m, 2H) .
- [0182] 化合物6-78:oil。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.72 (m, 2H), 7.68 (m, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.48 (m, 1H), 7.12 (m, 2H), 6.39 (s, 1H), 6.22 (s, 1H), 3.84 (m, 2H), 3.16 (m, 2H) .
- [0183] 化合物6-151:熔点117.0℃。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.70 (m, 2H), 7.58 (m, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.24 (m, 1H), 7.08 (m, 1H), 6.57 (s, 1H), 6.07 (s, 1H), 3.87 (m, 2H), 3.20 (m, 2H) .
- [0184] 化合物7-4:熔点161.8℃。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.77 (m, 2H), 7.15 (m, 2H), 7.12 (s, 1H), 6.40 (s, 1H), 3.90 (m, 2H), 3.20 (m, 2H) .
- [0185] 化合物7-19: $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.72 (m, 2H), 7.44 (m, 2H), 7.12 (s, 1H), 6.41 (s, 1H), 3.90 (m, 2H), 3.21 (m, 2H) .
- [0186] 化合物9-19:oil。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 8.61 (m, 1H), 8.22 (m, 1H), 7.71 (m, 3H), 7.43 (m, 2H), 6.48 (s, 1H), 6.20 (s, 1H), 3.90 (m, 2H), 3.24 (m, 2H), 3.11 (s, 3H) .
- [0187] 化合物10-19: $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.91 (s, 1H), 7.71 (m, 2H), 7.43 (m, 2H), 6.81 (t, 1H), 6.59 (s, 1H), 6.39 (s, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.80 (m, 2H), 3.14 (m, 2H) .
- [0188] 化合物10-21:oil。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.90 (s, 1H), 7.58 (m, 1H), 7.47 (m, 1H), 7.31 (m, 1H), 6.80 (t, 1H), 6.58 (s, 1H), 6.41 (s, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.81 (m, 2H), 3.15 (m, 2H) .
- [0189] 化合物11-4:熔点103.9。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.74 (m, 2H), 7.29 (m, 2H), 7.24 (m, 1H), 7.13 (m, 2H), 6.43 (s, 1H), 6.15 (s, 1H), 3.90 (m, 2H), 3.21 (m, 2H) .
- [0190] 化合物11-19: $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.70 (m, 2H), 7.43 (m, 2H), 7.25 (m, 3H), 6.45 (s, 1H), 6.10 (s, 1H), 3.90 (m, 2H), 3.22 (m, 2H) .
- [0191] 化合物12-4:熔点126℃。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 8.45 (m, 1H), 8.08 (m, 1H), 7.76 (m, 2H), 7.34 (m, 1H), 7.15 (m, 2H), 6.76 (s, 1H), 6.41 (s, 1H), 3.90 (m, 2H), 3.21 (m, 2H) .
- [0192] 化合物12-19: $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 8.451 (d, 1H), 7.72 (m, 2H), 7.65 (s, 1H), 7.51 (m, 1H),

7.43 (m, 1H) , 6.55 (s, 1H) , 6.40 (s, 1H) , 3.87 (m, 2H) , 3.19 (m, 2H) .

[0193] 化合物13-19:oil.δ (CDCl<sub>3</sub>) : 7.71 (m, 2H) , 7.34 (m, 2H) , 6.28 (s, 1H) , 6.29 (s, 1H) , 6.24 (s, 1H) , 4.10 (s, 3H) , 3.78 (m, 2H) , 3.15 (m, 2H) , 2.23 (s, 3H) .

[0194] 化合物14-19:δ (CDCl<sub>3</sub>) : 7.70 (m, 2H) , 7.42 (m, 2H) , 6.40 (s, 1H) , 6.39 (s, 1H) , 3.83 (m, 2H) , 3.16 (m, 2H) , 2.72 (s, 3H) .

[0195] 化合物15-4:oil.δ (CDCl<sub>3</sub>) : 7.68 (m, 1H) , 7.63 (m, 2H) , 7.58 (m, 1H) , 7.53 (m, 2H) , 7.45 (s, 1H) , 7.09 (m, 1H) , 6.37 (s, 1H) , 4.87 (m, 1H) , 3.70 (m, 1H) , 3.61 (m, 1H) , 3.48 (m, 1H) , 3.06 (m, 1H) , 2.09 (m, 1H) , 1.98 (m, 1H) .

[0196] 化合物15-17:oil.δ (CDCl<sub>3</sub>) : 7.69 (m, 1H) , 7.59 (m, 2H) , 7.53 (m, 2H) , 7.43 (m, 1H) , 7.35 (m, 1H) , 7.30 (m, 1H) , 6.33 (s, 1H) , 4.90 (m, 1H) , 3.73 (m, 1H) , 3.63 (m, 2H) , 3.25 (m, 1H) , 2.10 (m, 1H) , 2.04 (m, 1H) .

[0197] 化合物15-19:δ (CDCl<sub>3</sub>) : 7.70 (m, 1H) , 7.63 (m, 2H) , 7.58 (m, 3H) , 7.38 (m, 2H) , 6.31 (s, 1H) , 4.88 (m, 1H) , 3.70 (m, 2H) , 3.50 (m, 1H) , 3.05 (m, 1H) , 2.05 (m, 2H) , .

[0198] 化合物15-21:熔点102.2℃.δ (CDCl<sub>3</sub>) : 7.69 (m, 1H) , 7.55 (m, 4H) , 7.45 (s, 1H) , 7.28 (m, 1H) , 6.30 (s, 1H) , 4.90 (m, 1H) , 3.71 (m, 1H) , 3.62 (m, 2H) , 3.22 (m, 1H) , 2.05 (m, 2H) .

[0199] 化合物15-60:oil.δ (CDCl<sub>3</sub>) : 7.70 (m, 1H) , 7.58 (m, 1H) , 7.52 (m, 2H) , 7.15 (m, 2H) , 7.11 (m, 1H) , 6.33 (s, 1H) , 4.81 (m, 1H) , 3.74 (m, 1H) , 3.60 (m, 1H) , 3.55 (m, 1H) , 3.13 (m, 1H) , 2.48 (s, 3H) , 2.34 (s, 3H) , 2.09 (m, 1H) , 1.99 (m, 1H) .

[0200] 化合物15-69:熔点139℃.δ (CDCl<sub>3</sub>) : 7.77 (m, 2H) , 7.70 (m, 1H) , 7.66 (m, 2H) , 7.60 (m, 1H) , 7.54 (m, 2H) , 6.26 (s, 1H) , 4.94 (m, 1H) , 3.71 (m, 1H) , 3.64 (m, 1H) , 3.53 (m, 1H) , 3.10 (m, 1H) , 2.13 (m, 1H) , 2.02 (m, 1H) .

[0201] 化合物15-78:oil.δ (CDCl<sub>3</sub>) : 7.68 (m, 3H) , 7.58 (m, 1H) , 7.53 (m, 2H) , 7.25 (m, 2H) , 6.37 (s, 1H) , 4.89 (m, 1H) , 3.68 (m, 1H) , 3.61 (m, 1H) , 3.50 (m, 1H) , 3.06 (m, 1H) , 2.09 (m, 1H) , 1.99 (m, 1H) .

[0202] 化合物15-151:熔点60.5℃.δ (CDCl<sub>3</sub>) : 7.69 (m, 1H) , 7.60 (m, 2H) , 7.53 (m, 2H) , 7.18 (m, 1H) , 7.03 (m, 1H) , 6.31 (s, 1H) , 4.90 (m, 1H) , 3.73 (m, 1H) , 3.61 (m, 2H) , 3.22 (m, 1H) , 2.10 (m, 1H) , 2.01 (m, 1H) .

[0203] 化合物15-288:oil.δ (CDCl<sub>3</sub>) : 7.69 (m, 1H) , 7.58 (m, 3H) , 7.52 (m, 2H) , 7.42 (m, 2H) , 6.35 (s, 1H) , 4.85 (m, 1H) , 3.73 (m, 1H) , 3.61 (m, 1H) , 3.50 (m, 1H) , 3.06 (m, 1H) , 2.09 (m, 1H) , 1.97 (m, 1H) , 1.33 (s, 3H) .

[0204] 化合物16-4:oil.δ (CDCl<sub>3</sub>) : 7.65 (m, 2H) , 7.51 (s, 1H) , 7.11 (m, 2H) , 4.90 (m, 1H) , 3.83 (m, 1H) , 3.62 (m, 1H) , 3.52 (m, 1H) , 3.06 (m, 1H) , 2.12 (m, 1H) , 2.02 (m, 1H) .

[0205] 化合物16-17:oil.δ (CDCl<sub>3</sub>) : 7.60 (m, 1H) , 7.52 (s, 1H) , 7.43 (m, 1H) , 7.37 (m, 1H) , 7.31 (m, 1H) , 4.93 (m, 1H) , 3.85 (m, 1H) , 3.65 (m, 2H) , 3.26 (m, 1H) , 2.07 (m, 2H) .

[0206] 化合物16-21:熔点112.8℃.δ (CDCl<sub>3</sub>) : 7.59 (m, 1H) , 7.48 (s, 1H) , 7.45 (m, 1H) , 7.30 (m, 1H) , 4.93 (m, 1H) , 3.84 (m, 1H) , 3.63 (m, 2H) , 3.24 (m, 1H) , 2.07 (m, 2H) .

[0207] 化合物16-60:oil.δ (CDCl<sub>3</sub>) : 7.58 (s, 1H) , 7.16 (m, 1H) , 7.12 (m, 2H) , 4.85 (m, 1H) , 3.85 (m, 1H) , 3.63 (m, 1H) , 3.57 (m, 1H) , 3.12 (m, 1H) , 2.49 (s, 3H) , 2.34 (s, 3H) , 2.09 (m, 1H) , 2.01 (m, 1H) .

[0208] 化合物16-69:熔点104.8℃。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.78 (m, 3H), 7.67 (m, 2H), 7.47 (s, 1H), 4.96 (m, 1H), 3.83 (m, 1H), 3.62 (m, 1H), 3.54 (m, 1H), 3.09 (m, 1H), 2.14 (m, 1H), 2.04 (m, 1H)。

[0209] 化合物16-78:oil。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.70 (m, 2H), 7.50 (s, 1H), 7.25 (m, 2H), 4.93 (m, 1H), 3.83 (m, 1H), 3.63 (m, 1H), 3.52 (m, 1H), 3.07 (m, 1H), 2.13 (m, 1H), 2.02 (m, 1H)。

[0210] 化合物16-151:熔点106.1℃。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.63 (m, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.19 (m, 1H), 7.05 (m, 1H), 4.92 (m, 1H), 3.85 (m, 1H), 3.63 (m, 2H), 3.24 (m, 1H), 2.07 (m, 2H)。

[0211] 化合物16-288:熔点142℃。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.60 (m, 2H), 7.54 (s, 1H), 7.43 (m, 2H), 4.89 (m, 1H), 3.84 (m, 1H), 3.63 (m, 1H), 3.52 (m, 1H), 3.07 (m, 1H), 2.11 (m, 1H), 2.00 (m, 1H), 1.33 (s, 3H)。

[0212] 化合物17-19:熔点184.1℃。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 8.00 (d, 1H), 7.88 (m, 1H), 7.80 (m, 1H), 7.59 (m, 2H), 7.40 (m, 2H), 6.69 (s, 1H), 4.92 (m, 1H), 3.80 (m, 1H), 3.64 (m, 1H), 3.51 (m, 1H), 3.08 (m, 4H), 2.13 (m, 1H), 2.03 (m, 1H)。

[0213] 化合物18-19:熔点189.1℃。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 8.60 (d, 1H), 8.22 (m, 1H), 7.78 (m, 1H), 7.57 (m, 2H), 7.39 (m, 2H), 6.65 (s, 1H), 4.92 (m, 1H), 3.79 (m, 1H), 3.63 (m, 1H), 3.52 (m, 1H), 3.12 (s, 3H), 3.08 (m, 1H), 2.14 (m, 1H), 2.02 (m, 1H)。

[0214] 化合物19-19: $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.88 (s, 1H), 7.59 (m, 2H), 7.37 (m, 2H), 6.90 (t, 1H), 6.64 (s, 1H), 4.87 (m, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.61 (m, 2H), 3.46 (m, 1H), 3.03 (m, 1H), 2.03 (m, 2H)。

[0215] 化合物20-19: $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.57 (m, 2H), 7.37 (m, 2H), 7.25 (m, 3H), 6.27 (s, 1H), 4.93 (m, 1H), 3.68 (m, 2H), 3.48 (m, 1H), 2.07 (m, 2H)。

[0216] 化合物21-19: $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 8.52 (d, 1H), 7.71 (m, 1H), 7.60 (m, 2H), 7.54 (m, 1H), 7.39 (m, 2H), 6.97 (s, 1H), 4.92 (m, 1H), 3.82 (m, 1H), 3.56 (m, 2H), 3.07 (m, 1H), 2.05 (m, 2H)。

[0217] 化合物22-19:oil。 $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.70 (m, 2H), 7.35 (m, 2H), 6.29 (s, 1H), 6.27 (s, 1H), 6.24 (s, 1H), 4.11 (s, 3H), 3.79 (m, 2H), 3.16 (m, 2H), 2.23 (s, 3H)。

[0218] 化合物23-19: $\delta$  (CDCl<sub>3</sub>): 7.58 (m, 2H), 7.38 (m, 2H), 6.64 (s, 1H), 4.86 (m, 1H), 3.62 (m, 2H), 3.48 (m, 1H), 3.05 (m, 1H), 2.74 (s, 3H), 2.01 (m, 2H)。

[0219] 同时,按照上述各合成实施例中记载的内容将相应的原料进行替换即可获得本发明通式I所示的其他化合物。

[0220] 生物活性测定实施例

[0221] 本发明化合物对农业领域中的多种病菌表现出很好的活性。

[0222] 实施例5:杀菌活性测定

[0223] 用本发明化合物样品对植物的多种真菌病害进行了离体抑菌活性或活体保护效果试验。杀菌活性测定结果见以下各实施例。

[0224] (1) 离体杀菌活性测定

[0225] 测定方法如下:采用高通量筛选方法,即将待测化合物样品用适合的溶剂(溶剂的种类如丙酮、甲醇、DMF等,并且依据其对样品的溶解能力而选择)溶解,配制成所需浓度待测液。在超净工作环境下,将待测液加入到96孔培养板的微孔中,再将病原菌繁殖体悬浮液加入其中,处理后的培养板放置在恒温培养箱中培养。24小时后进行调查,调查时目测病原菌繁殖体萌发或生长情况,并根据对照处理的萌发或生长情况,评价化合物抑菌活性。

[0226] 部分化合物的离体抑菌活性(以抑制率表示)测试结果如下:

[0227] 对稻瘟病菌的抑制率：

[0228] 在25ppm剂量下，本发明提供的化合物对稻瘟病具有良好的抑制率，例如，化合物12-19等，对稻瘟病的抑制率在80%以上。

[0229] (2) 活体保护活性测定

[0230] 测定方法如下：采用活体盆栽测定方法，即将待测化合物样品用少量溶剂（溶剂的种类如丙酮、甲醇、DMF等，并且依据其对样品的溶解能力而选择，溶剂量与喷液量的体积比等于或小于0.05）溶解，用含有0.1%吐温80的水稀释，配制成所需浓度待测液。在作物喷雾机上，将待测液喷施于病害寄主植物上（寄主植物为在温室内培养的标准盆栽苗），24小时后进行病害接种。依据病害特点，将需要控温保湿培养的病态植物接种后放在人工气候室中培养，待病害完成侵染后，移入温室培养，将不需要保湿培养的病态植物直接在温室内接种并培养。待对照充分发病后（通常为一周时间）进行化合物防病效果评估。

[0231] 部分化合物的活体保护活性测试结果如下：

[0232] (1) 黄瓜霜霉病

[0233] 400ppm剂量下，本发明提供的化合物对黄瓜霜霉病具有良好的抑制率，例如，化合物6-1、6-4、6-19、6-57、6-78、6-288、7-4、10-21、11-4、12-4、12-19、13-19、14-19、15-19、15-21、15-151、15-69、16-4、16-17、16-19、16-21、16-60、16-69、16-78、16-151、16-288、19-19、20-19、21-19、23-19等，对黄瓜霜霉病防效在80%以上；

[0234] 在100ppm剂量下，化合物6-19、6-288、12-19、13-19、16-69、16-151，对黄瓜霜霉病具有良好的抑制率，对黄瓜霜霉病防效在85%以上；

[0235] 在25ppm剂量下，化合物6-19、12-19，对黄瓜霜霉病具有更好的抑制率，例如，等，对黄瓜霜霉病防效在90%以上；

[0236] (2) 小麦白粉病

[0237] 400ppm剂量下，本发明提供的化合物对小麦白粉病具有良好的抑制率，例如，化合物6-57、6-288、11-4、12-4、12-19、16-4、16-60、23-19等，对小麦白粉病防效在80%以上；

[0238] 在100ppm剂量下，化合物6-57、6-288、16-60，对小麦白粉病具有良好的抑制率，对小麦白粉病防效在85%以上；

[0239] 在25ppm剂量下，化合物6-57、6-288，对小麦白粉病具有更好的抑制率，对小麦白粉病防效在90%以上；

[0240] (3) 玉米锈病

[0241] 400ppm剂量下，本发明提供的化合物对玉米锈病具有良好的抑制率，例如，化合物6-1、7-4、10-21、11-4、12-4、12-19等，对玉米锈病防效在80%以上；

[0242] 在100ppm剂量下，化合物7-4、10-21、11-4、12-4，对玉米锈病具有良好的抑制率，对玉米锈病防效在85%以上；

[0243] (4) 黄瓜炭疽病

[0244] 400ppm剂量下，本发明提供的化合物对瓜类炭疽病具有良好的抑制率，例如，化合物6-151、16-17、16-19、16-21、16-60、16-151、18-19等，对瓜类炭疽病防效在80%以上。

[0245] 在100ppm剂量下，化合物16-17、16-19、16-21、16-69、16-151，对瓜类炭疽病具有良好的抑制率，对玉米锈病防效在85%以上；

[0246] 在25ppm剂量下，化合物16-19、16-21、16-151，对瓜类炭疽病具有良好的抑制率，



对小麦白粉病防效在90%以上；

[0247] 由上述数据可见本发明结构新颖的通式I所示化合物对农业领域中的多种病菌表现出很好的活性,并且在一些低剂量下化合物表现出突出的活性效果,与对照化合物相比活性效果优异。

[0248] 依照上述生物活性测定的方式对本发明通式I所示的其他化合物进行相应的测试,其也可具有相应的活性。