



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 110964037 B

(45) 授权公告日 2023.03.28

(21) 申请号 201811146769.9

C07D 487/04 (2006.01)

(22) 申请日 2018.09.29

A01N 43/90 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

(65) 同一申请的已公布的文献号
申请公布号 CN 110964037 A

(56) 对比文件

(43) 申请公布日 2020.04.07

CN 105753791 A, 2016.07.13

CN 108069973 A, 2018.05.25

(73) 专利权人 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

US 2007/0093498 A1, 2007.04.26

CN 104220428 A, 2014.12.17

CN 104220428 A, 2014.12.17

(72) 发明人 李淼 杨吉春 孙芹 吴峤 兰杰
刘长令

Carla JR Klittich et al..Assessment
of fungicide systemicity in wheat using
LC-MS/MS.《Pest Manag Sci》.2008,第64卷第
1267-1277页.

(74) 专利代理机构 沈阳科苑专利商标代理有限
公司 21002

审查员 朱亚莉

专利代理师 李颖

(51) Int.Cl.

C07D 498/04 (2006.01)

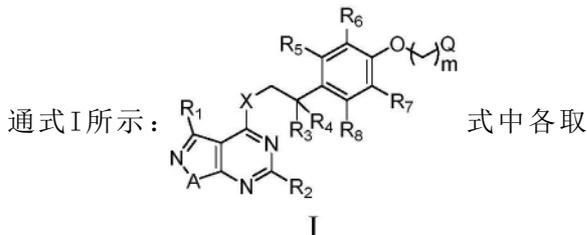
权利要求书2页 说明书33页

(54) 发明名称

含嘧啶并环类化合物及其制备方法和用途

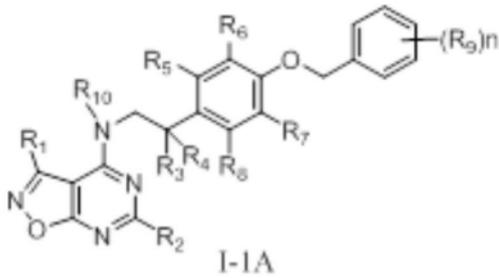
(57) 摘要

本发明公开了一种含嘧啶并环类化合物及其制备方法和用途,含嘧啶并环类化合物结构如



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、小麦白粉病等具有优良的防治效果。

1. 一种含嘧啶并环类化合物,其特征在于:
结构为I-1A



式中:

R_1 选自 C_1 - C_4 烷基;

R_2 选自氢;

R_3 、 R_4 分别选自氢;

R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 分别选自氢;

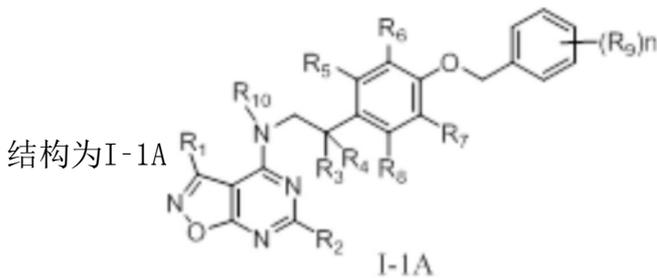
R_{10} 选自氢;

R_9 选自卤素、 C_1 - C_4 烷基;

通式I-1A中,n选自1至5的整数;

或通式I-1A所示化合物的盐为:通式I-1A所示的化合物与盐酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、三氟乙酸、草酸、甲磺酸、对甲苯磺酸、苯甲酸、邻苯二甲酸、马来酸、富马酸、山梨酸、苹果酸或柠檬酸形成的盐。

2. 一种含嘧啶并环类化合物,其特征在于:



式中:

R_1 选自甲基;

R_2 选自氢;

R_3 、 R_4 分别选自氢;

R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 分别选自氢;

R_{10} 选自氢;

R_9 选自氢。

3. 根据权利要求1所述的含嘧啶并环类化合物,其特征在于:通式I-1A所示化合物中:

R_1 选自甲基;

R_2 选自氢;

R_3 、 R_4 分别选自氢;

R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 分别选自氢;

R₉选自氟、氯、甲基、正丁基；

通式I-1A中,n选自1至5的整数；

或通式I-1A所示化合物的盐为：通式I-1A所示的化合物与盐酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、三氟乙酸、草酸、甲磺酸、对甲苯磺酸、苯甲酸、邻苯二甲酸、马来酸、富马酸、山梨酸、苹果酸或柠檬酸形成的盐。

4. 一种按照权利要求1-3任一项所述含嘧啶并环类化合物在农业领域中用作制备杀菌剂药物的用途。

5. 一种杀菌组合物,其特征在于:含有权利要求1-3任一项所述含嘧啶并环类化合物作为活性组分;其中,组合物中活性组分的重量百分含量为0.1-99%。

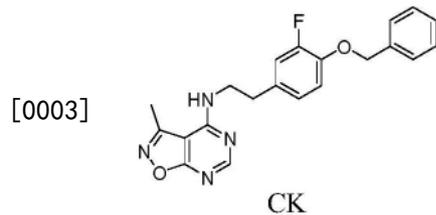
含嘧啶并环类化合物及其制备方法和用途

技术领域

[0001] 本发明属农用杀菌剂领域,具体涉及一种新型的含嘧啶并环类化合物及其制备方法和用途。

背景技术

[0002] 文章Pest Management Science (2008), 64 (12), 1267-1277公布了如下结构所示的异恶唑并嘧啶类化合物作为农用杀菌剂的应用。



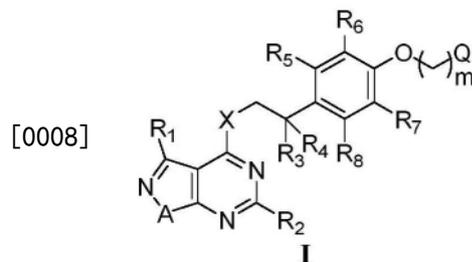
[0004] 但结构如本发明通式I所示的含嘧啶并环类化合物未见报道。

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含嘧啶并环类化合物,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] 一种含嘧啶并环类化合物,结构如通式I所示:



[0009] 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_1 - C_{12} 烷硫基、卤代 C_1 - C_{12} 烷硫基、 C_1 - C_{12} 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_{12} 烷基磺酰基、 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} 烷基氨基、二(C_1 - C_{12} 烷基)氨基、 C_1 - C_{12} 烷基氨基羰基、卤代 C_1 - C_{12} 烷基氨基羰基、 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、 C_1 - C_{12} 烷硫基 C_1 - C_{12} 烷基、 C_1 - C_{12} 烷基羰基、卤代 C_1 - C_{12} 烷基羰基、未取代的或被1-5个 R_{11} 取代的芳基、芳甲基、芳基羰基、芳甲基羰基、芳氧基羰基、杂芳基、杂芳甲基、杂芳基羰基、杂芳甲基羰基或杂芳氧基羰基;

[0010] R_2 选自氢、卤素、 C_1 - C_{12} 烷基、卤代 C_1 - C_{12} 烷基、 C_3 - C_8 环烷基、 C_1 - C_{12} 烷氧基、 C_1 - C_{12} 烷硫基或 C_1 - C_{12} 烷基磺酰基;

[0011] R_3 、 R_4 可相同或不同,分别选自氢、卤素、羟基、氨基、 C_1 - C_{12} 烷基、 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、未取代的或被1-5个如下基团进一步取代的芳基、 C_1-C_6 烷基或杂芳基、 C_1-C_6 烷基，如下基团为卤素、 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；

[0012] 所述 R_3 、 R_4 还可与相连的碳组成 C_3-C_8 的环；

[0013] R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 可相同或不同，分别选自氢、卤素、羟基、硝基、氰基、 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_1-C_{12} 烷硫基、卤代 C_1-C_{12} 烷硫基、 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} 烷基羰基、卤代 C_1-C_{12} 烷基羰基、 C_1-C_{12} 烷基羰基氧基、 C_1-C_{12} 烷基羰基氨基、 C_1-C_{12} 烷基磺酰基氧基、 C_1-C_{12} 烷氧基羰基、 C_1-C_{12} 烷氧基羰基、 C_1-C_{12} 烷基、 C_1-C_{12} 烷氧基羰基氨基、 C_1-C_{12} 烷氧基、 C_1-C_{12} 烷氧基或 C_1-C_{12} 烷氧基羰基、 C_1-C_{12} 烷氧基；且， R_6 、 R_7 不单独为氟（即， R_6 、 R_7 可同时为氟或同时不为氟）；

[0014] A选自 NR_{10} 、O或S；

[0015] X选自 NR_{10} 、O或S；

[0016] R_{10} 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_1-C_{12} 烷硫基、 C_2-C_{12} 烯基硫基、 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、 C_1-C_{12} 烷基氨基硫基、二(C_1-C_{12} 烷基)氨基硫基、未取代的或被1-5个如下基团进一步取代的芳基羰基、 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；

[0017] m选自0或1；

[0018] Q选自未取代的或被1-5个 R_9 取代的苯基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、哌嗪基；

[0019] R_9 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、卤代 C_1-C_{12} 烷氧基、 C_1-C_{12} 烷氧基、未取

代的或被1-5个 R_{11} 取代的芳基、芳甲基、芳基羰基、芳甲基羰基、芳氧基羰基、杂芳基、杂芳甲基、杂芳基羰基、杂芳甲基羰基或杂芳氧基羰基；

[0020] R_{11} 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、 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} 烷基或 C_1 - C_{12} 烷氧基羰基 C_1 - C_{12} 烷基；

[0021] 或通式I所示化合物的盐。

[0022] 优选，通式I化合物中

[0023] 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_1 - C_6 烷硫基、卤代 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 烷基亚磺酰基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基、 C_1 - 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 烷基氨基、二(C_1 - C_6 烷基)氨基、 C_1 - C_6 烷基氨基羰基、卤代 C_1 - C_6 烷基氨基羰基、 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、 C_1 - C_6 烷硫基 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷基羰基、卤代 C_1 - C_6 烷基羰基、未取代的或被1-5个 R_{11} 取代的芳基、芳甲基、芳基羰基、芳甲基羰基、芳氧基羰基、杂芳基、杂芳甲基、杂芳基羰基、杂芳甲基羰基或杂芳氧基羰基；

[0024] R_2 选自氢、卤素、 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、 C_1 - C_6 烷硫基或 C_1 - C_6 烷基磺酰基；

[0025] R_3 、 R_4 可相同或不同，分别选自氢、卤素、羟基、氨基、 C_1 - C_6 烷基、 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、未取代的或被1-5个如下基团进一步取代的芳基 C_1 - C_6 烷基或杂芳基 C_1 - C_6 烷基，如下基团为卤素、 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] 或所述 R_3 、 R_4 还可与相连的碳组成 C_3 - C_8 的环；

[0027] R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 可相同或不同，分别选自氢、卤素、羟基、硝基、氰基、 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_1 - C_6 烷硫基、卤代 C_1 - C_6 烷硫基、 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 烷基羰基、卤代 C_1 - C_6 烷基羰基、 C_1 - C_6 烷基羰基氧基、 C_1 - C_6 烷基羰基氨基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基氧基、 C_1 - C_6 烷氧基羰基、 C_1 - C_6 烷氧基羰基 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基羰基氨基、 C_1 - C_6 烷氧基 C_1 - C_6 烷氧基或 C_1 - C_6 烷氧基羰基 C_1 - C_6 烷氧基；且， R_6 、 R_7 不单独为氟；

[0028] A选自 NR_{10} 、O或S；

[0029] X选自 NR_{10} 、O或S；

[0030] R_{10} 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_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 烯基硫基、 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_{12} 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、 C_1-C_6 烷基氨基磺基、二(C_1-C_6 烷基)氨基磺基、未取代的或被1-5个如下基团进一步取代的芳基羰基 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；

[0031] m选自0或1；

[0032] Q选自未取代的或被1-5个 R_9 取代的苯基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、哌嗪基；

[0033] R_9 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、卤代 C_1-C_6 烷氧基 C_1-C_6 烷氧基、未取代的或被1-5个 R_{11} 取代的芳基、芳甲基、芳基羰基、芳甲基羰基、芳氧基羰基、杂芳基、杂芳甲基、杂芳基羰基、杂芳甲基羰基或杂芳氧基羰基；

[0034] R_{11} 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、 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 烷基或卤代 C_1-C_6 烷硫基 C_1-C_6 烷基；

[0035] 或通式I所示化合物的盐。

[0036] 较优选，通式I中

[0037] 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_1-C_6 烷硫基、卤代 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷基亚磺酰基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、 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、未取代的或被1-5个 R_{11} 取代的苯基、吡啶基、嘧啶基、三唑基、恶唑基、噁二唑基、恶二唑基、呋喃基、噁吩基、噻唑基、苜基、吡啶甲基、噁吩甲基或噻唑甲基；

[0038] R_2 选自氢、卤素、 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、 C_1-C_6 烷硫基或 C_1-C_6 烷基磺酰基；

[0039] R_3 、 R_4 可相同或不同，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；

[0040] R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 可相同或不同,分别选自氢、卤素、羟基、硝基、氰基、 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_1 - C_6 烷硫基、卤代 C_1 - C_6 烷硫基、 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 烷基羰基、卤代 C_1 - C_6 烷基羰基、 C_1 - C_6 烷基羰基氧基、 C_1 - C_6 烷基羰基氨基、 C_1 - C_6 烷基磺酰基氧基、 C_1 - C_6 烷氧基羰基、 C_1 - C_6 烷氧基羰基 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷氧基羰基氨基、 C_1 - C_6 烷氧基 C_1 - C_6 烷氧基或 C_1 - C_6 烷氧基羰基 C_1 - C_6 烷氧基;且 R_6 、 R_7 不单独为氟;

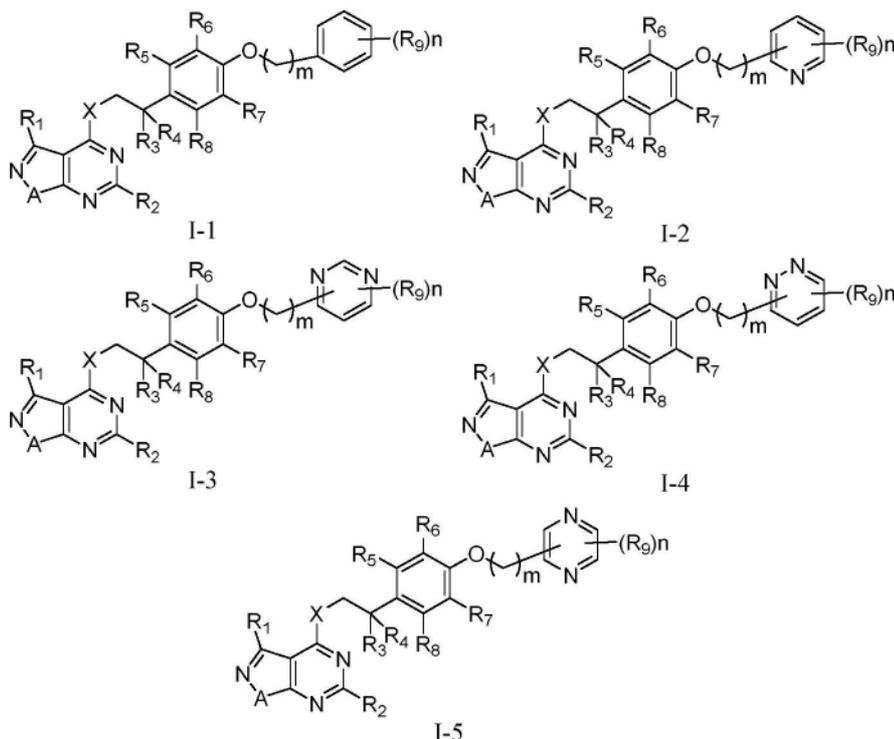
[0041] A选自 NR_{10} 、O或S;

[0042] X选自 NR_{10} 、O或S;

[0043] R_{10} 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_1 - C_6 烷硫基、 C_2 - C_6 烯基硫基、 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;

[0044] m选自0或1;

[0045] 当Q为苯环,通式I的结构式如I-1所示,其中n选自1至5的整数;当Q为吡啶环,通式I的结构式如I-2所示,其中n选自1至4的整数;当Q为嘧啶环,通式I的结构式如I-3所示,n选自0至3的整数;当Q为哒嗪环,通式I的结构式如I-4所示,n选自0至3的整数;当Q为吡嗪环,通式I的结构式如I-5所示,n选自0至3的整数;



[0047] R_9 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、 $C(=O)NR_9R_{10}$ 、 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、未取代的或被1-5个 R_{11} 取代的苯基、吡啶基、嘧啶基、三唑基、恶唑基、噻二唑基、恶二唑基、呋喃基、噻吩基、噻唑基、苜基、吡啶甲基、噻吩甲基或噻唑甲基；

[0048] R_{11} 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、 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 烷基或卤代 C_1 - C_4 烷硫基 C_1 - C_4 烷基；

[0049] 或，通式I-1、I-2、I-3、I-4或I-5所示的化合物与盐酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、三氟乙酸、草酸、甲磺酸、对甲苯磺酸、苯甲酸、邻苯二甲酸、马来酸、富马酸、山梨酸、苹果酸或柠檬酸形成的盐。

[0050] 进一步优选，所述通式I-1、I-2、I-3、I-4或I-5所示的化合物中A选自NR₁₀时，

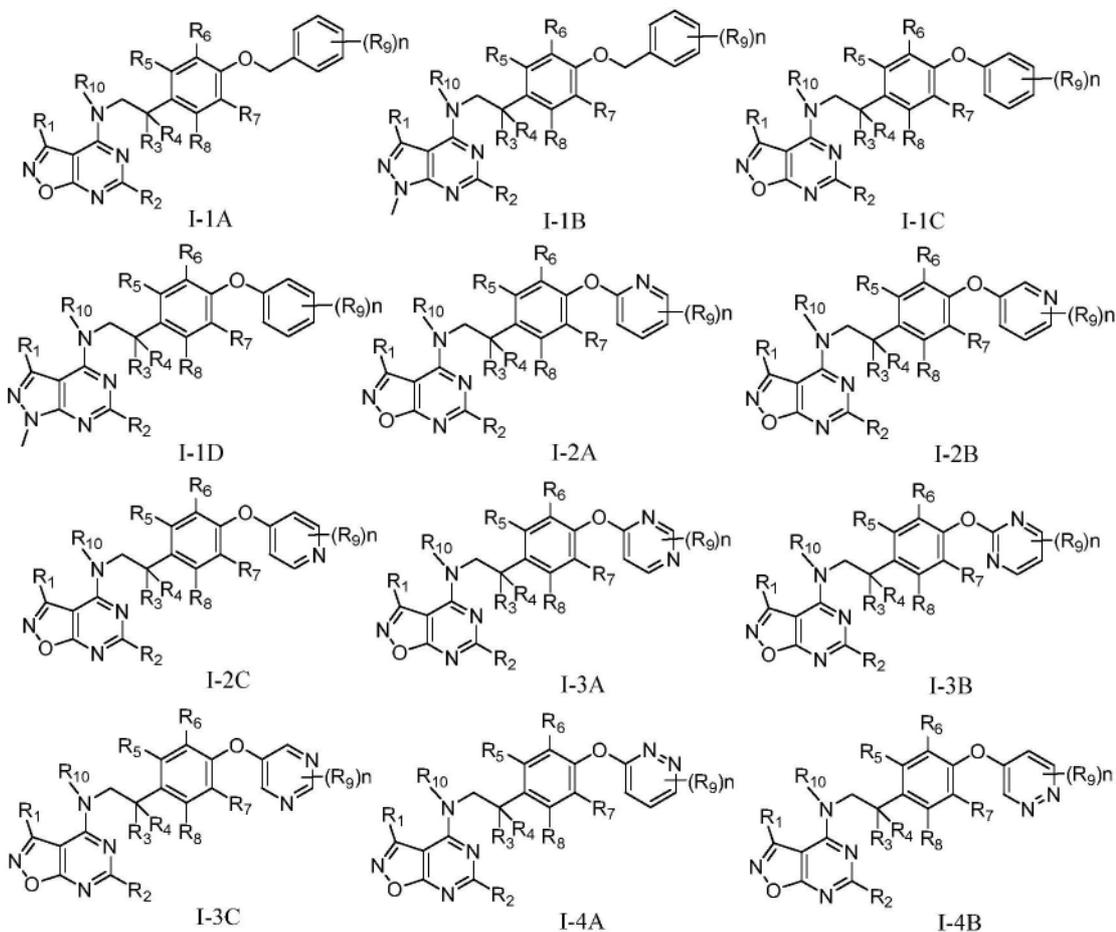
[0051] 通式I-1所示化合物的结构为：I-1A、I-1B、I-1C或I-1D；

[0052] 通式I-2所示化合物的结构为I-2A、I-2B或I-2C；

[0053] 通式I-3所示化合物的结构为I-3A、I-3B或I-3C；

[0054] 通式I-4所示化合物的结构为I-4A或I-4B；

[0055] 通式I-5所示化合物的结构为I-5A或I-5B；



[0056]

自1至4的整数;I-3A、I-3B、I-3C、I-4A、I-4B、I-5A或I-5B中,n选自0至3的整数;

[0067] 通式I所示化合物的盐为:通式I-1A、I-1B、I-1C、I-1D、I-2A、I-2B、I-2C、I-3A、I-3B、I-3C、I-4A、I-4B、I-5A或I-5B所示的化合物与盐酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、三氟乙酸、草酸、甲磺酸、对甲苯磺酸、苯甲酸、邻苯二甲酸、马来酸、富马酸、山梨酸、苹果酸或柠檬酸形成的盐。

[0068] 再进一步优选,通式I-1A、I-1B、I-1C、I-1D、I-2A、I-2B、I-2C、I-3A、I-3B、I-3C、I-4A、I-4B、I-5A或I-5B所示化合物中:

[0069] R_1 选自氢、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、一氟甲基、一氯甲基、二氟甲基、三氟甲基、三氟乙基、环丙基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、三氟乙氧基甲基、未取代的或被1-5个 R_{11} 取代的苯基、吡啶基、呋喃基、噻吩基、噻唑基或苄基;

[0070] R_2 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、一氟甲基、一氯甲基、二氟甲基、三氟甲基、三氟乙基、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲基磺酰基或乙基磺酰基;

[0071] R_3 、 R_4 可相同或不同,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;

[0072] R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 可相同或不同,分别选自氢、卤素、羟基、硝基、氰基、 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;且, R_6 、 R_7 不单独为氟;

[0073] R_9 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、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、三氟甲氧基、三氟乙氧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、氨基羰基、甲基氨基羰基、乙基氨基羰基、二甲氨基羰基、未取代的或被1-5个 R_{11} 取代的苯基、吡啶基、呋喃基、噻吩基、噻唑基或苄基;

[0074] R_{11} 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、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、三氟甲氧基或三氟乙氧基;

[0075] R_{10} 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、甲硫基、乙硫基、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、甲氨基硫基、乙氨基硫基或二甲氨基硫基;

[0076] 通式I-1A、I-1B、I-1C或I-1D中,n选自1至5的整数;通式I-2A、I-2B或I-2C中,n选自1至4的整数;I-3A、I-3B、I-3C、I-4A、I-4B、I-5A或I-5B中,n选自0至3的整数;

[0077] 通式I所示化合物的盐为:通式I-1A、I-1B、I-1C、I-1D、I-2A、I-2B、I-2C、I-3A、I-3B、I-3C、I-4A、I-4B、I-5A或I-5B所示的化合物与盐酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、三氟乙酸、草酸、甲磺酸、对甲苯磺酸、苯甲酸、邻苯二甲酸、马来酸、富马酸、山梨酸、苹果酸或柠檬酸形成的盐。

[0078] 更进一步优选,通式I-1A、I-1B、I-1C、I-1D、I-2A、I-2B、I-2C、I-3A、I-3B、I-3C、I-

4A、I-4B、I-5A或I-5B所示化合物中：

[0079] R_1 选自氢、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、环丙基、未取代的或被1-4个 R_{11} 取代的苯基、吡啶基；

[0080] R_2 选自氢、氟、氯、溴、碘或甲基；

[0081] R_3 、 R_4 均选自氢；

[0082] R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 可相同或不同，分别选自氢、卤素、羟基、硝基、氰基、 C_1 - C_6 烷基；且， R_6 、 R_7 不单独为氟；

[0083] R_9 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、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、三氟甲氧基、三氟乙氧基、未取代的或被1-4个 R_{11} 取代的苯基、吡啶基；

[0084] R_{11} 选自氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、甲基、三氟甲基、甲氧基或三氟甲氧基；

[0085] R_{10} 选自氢、甲基、乙酰基、三氟乙酰基、甲氧基、甲硫基、烯丙基、甲磺酰基、甲氨基磺酰基、二甲氨基磺酰基、甲氧基羰基、甲氨基羰基、二甲氨基羰基、甲氨基硫基或二甲氨基硫基；

[0086] 通式I-1A、I-1B、I-1C或I-1D中， n 选自1至5的整数；通式I-2A、I-2B或I-2C中， n 选自1至4的整数；I-3A、I-3B、I-3C、I-4A、I-4B、I-5A或I-5B中， n 选自0至3的整数；

[0087] 通式I所示化合物的盐为：通式I-1A、I-1B、I-1C、I-1D、I-2A、I-2B、I-2C、I-3A、I-3B、I-3C、I-4A、I-4B、I-5A或I-5B所示的化合物与盐酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、三氟乙酸、草酸、甲磺酸、对甲苯磺酸、苯甲酸、邻苯二甲酸、马来酸、富马酸、山梨酸、苹果酸或柠檬酸形成的盐。

[0088] 最优选，通式I-1A、I-1B、I-1C、I-1D、I-2A、I-2B、I-2C、I-3A、I-3B、I-4A、I-5A或I-5B所示化合物中：

[0089] R_1 选自氢、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、环丙基；

[0090] R_2 选自氢、氟、氯、溴、碘或甲基；

[0091] R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 均选自氢；

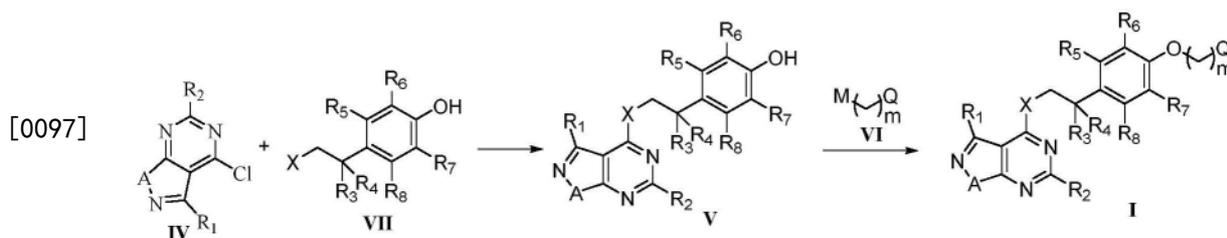
[0092] R_9 选自氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、甲基、三氟甲基、甲氧基、或三氟甲氧基；

[0093] R_{10} 选自氢、甲基、乙酰基、三氟乙酰基、甲氧基、甲硫基、烯丙基、甲磺酰基、甲氨基磺酰基、二甲氨基磺酰基、甲氧基羰基、甲氨基羰基、二甲氨基羰基、甲氨基硫基或二甲氨基硫基；

[0094] 通式I-1A、I-1B、I-1C或I-1D中， n 选自1至5的整数；通式I-2A、I-2B或I-2C中， n 选自1至4的整数；I-3A、I-3B、I-4A、I-5A或I-5B中， n 选自0至3的整数；

[0095] 通式I所示化合物的盐为：通式I-1A、I-1B、I-1C、I-1D、I-2A、I-2B、I-2C、I-3A、I-3B、I-4A、I-5A或I-5B所示的化合物与盐酸、硫酸、磷酸、甲酸、乙酸、三氟乙酸、草酸、甲磺酸、对甲苯磺酸、苯甲酸、邻苯二甲酸、马来酸、富马酸、山梨酸、苹果酸或柠檬酸形成的盐。

[0096] 一种含嘧啶并环类化合物的制备方法，通式I所示化合物按下述反应式制备获得，



[0098] 一种通式I所示含嘧啶并环类化合物在农业或其他领域中用作制备杀菌剂药物的用途。

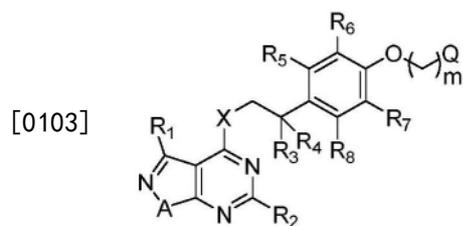
[0099] 一种杀菌组合物,含有如所述通式I所示含嘧啶并环类化合物作为活性组分;其中,组合物中活性组分的重量百分含量为0.1-99%。

[0100] 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:

[0101] 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 $\text{CH}_3\text{NHS-}$ 、 $\text{C}_2\text{H}_5\text{NHS-}$ 。二烷基氨基磺基:如 $(\text{CH}_3)_2\text{NS-}$ 、 $(\text{C}_2\text{H}_5)_2\text{NS-}$ 。烷基氨基磺酰基:烷基-NH-SO₂-。二烷基氨基磺酰基:(烷基)₂-N-SO₂-。烷基磺酰基氨基羰基:烷基-SO₂-NH-CO-。烷基羰基氨基磺酰基:烷基-CO-NH-SO₂-。烷基羰基烷基:烷基-CO-烷基-。烷基磺酰基氧基:烷基-S(O)₂-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 $\text{CF}_3\text{-SO}_2\text{-O}$ 。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 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{OCO-}$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{OCO-}$ 等。烷氧基烷基:烷基-O-烷基-,例如 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{-}$ 。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 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{-}$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{-}$ 等。烷氧基羰基烷基:烷氧基羰基-烷基-,例如 $\text{CH}_3\text{OCOCH}_2\text{-}$ 。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 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{OCOCH}_2\text{-}$ 。烷基羰基氧基:如 $\text{CH}_3\text{COO-}$ 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 $\text{CF}_3\text{COO-}$ 等。烷氧基羰基氧基:烷氧基羰基-氧基-,例如 $\text{CH}_3\text{OCOO-}$ 。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 $\text{CF}_3\text{OCOO-}$ 。烷硫基羰基烷基:烷硫基羰基-烷基-,例如 $\text{CH}_3\text{SCOCH}_2\text{-}$ 。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 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{SCOCH}_2\text{-}$ 。烷氧基烷氧基:如 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{O-}$ 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 $\text{CF}_3\text{OCH}_2\text{O-}$ 。烷氧基烷氧基羰基:如 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{OCO-}$ 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 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2-$ 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-NH-CO-，例如 $\text{CH}_3\text{NHC}-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}-$ 。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。例如呋喃基、吡唑基、噁唑基、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-噁唑-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 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。

[0102] 本发明通式I化合物中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 R_8 、 R_9 (Q上取代基) 和 R_{10} ($\text{X}=\text{NR}_{10}$) 的部分具体取代基分别于表1、表2、表3、表4、表5、表6中列举，但它们并非仅限于这些取代基。



[0104] 表1 R_1 取代基

	R₁	R₁	R₁	R₁
	H	F	Cl	Br
[0105]	I	CH ₃	C ₂ H ₅	<i>n</i> -C ₃ H ₇
	<i>i</i> -C ₃ H ₇	<i>n</i> -C ₄ H ₉	<i>s</i> -C ₄ H ₉	<i>i</i> -C ₄ H ₉

	<i>t</i> -C ₄ H ₉	CF ₃	CCl ₃	CHF ₂
	CH ₂ Cl	CHBr ₂	CF ₃ CH ₂	CH(CH ₃)F
	CH(CH ₃)Cl	CH(CH ₃)Br	C(CH ₃) ₂ F	CH=CH ₂
	C≡CH	SCH ₃	SOCH ₃	SO ₂ CH ₃
	CN	NO ₂	NH ₂	COOH
	COOCH ₃	COOC ₂ H ₅	CH ₃ NH	C ₂ H ₅ NH
[0106]	OCH ₃	OC ₂ H ₅	OCF ₃	OCH ₂ CH=CH ₂
	OCH ₂ CH=CHCl	OCH ₂ C≡CH	OCH ₂ C≡C-I	OCH ₂ C≡CCH ₃
	CONH ₂	CONHCH ₃	CON(CH ₃) ₂	NHCH ₃
	NHC ₂ H ₅	N(CH ₃) ₂	N(C ₂ H ₅) ₂	CH ₂ OCH ₃
	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃
	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃			

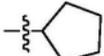
[0107] 表2R₂取代基

	R₂	R₂	R₂	R₂	R₂
	H	<i>i</i> -C ₃ H ₇	CHF ₂	OCH ₃	SCH ₃
	F	<i>n</i> -C ₄ H ₉	CHBr ₂	OC ₂ H ₅	SC ₂ H ₅
	Cl	<i>i</i> -C ₄ H ₉	CF ₃	OC ₃ H _{7-n}	SC ₃ H _{7-n}
	Br	CH ₃	CH(CH ₃)F	OC ₃ H _{7-i}	SC ₃ H _{7-i}
[0108]	I	C ₂ H ₅	CH(CH ₃)Cl	OC ₄ H _{9-n}	SC ₄ H _{9-n}
		CHCl ₂	CH(CH ₃)Br	OC ₄ H _{9-i}	SC ₄ H _{9-i}
		CCl ₃	CH(<i>n</i> -C ₄ H ₉)F	OC ₄ H _{9-t}	SC ₄ H _{9-t}
			C(CH ₃) ₂ F	OCF ₃	SO ₂ CH ₃
			<i>n</i> -C ₃ H ₇	OCH ₂ CF ₃	<i>t</i> -C ₄ H ₉

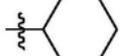
[0109] 表3R₃ (R₄) 取代基

	R₄(R₅)	R₄(R₅)	R₄(R₅)	R₄(R₅)
	H	F	Cl	Br
	I	CH ₃	C ₂ H ₅	<i>n</i> -C ₃ H ₇
	<i>i</i> -C ₃ H ₇	<i>n</i> -C ₄ H ₉	<i>s</i> -C ₄ H ₉	<i>i</i> -C ₄ H ₉
	<i>t</i> -C ₄ H ₉	CF ₃	CCl ₃	CHF ₂
	CH ₂ Cl	CHBr ₂	CF ₃ CH ₂	CH(CH ₃)F
	CH(CH ₃)Cl	CH(CH ₃)Br	C(CH ₃) ₂ F	OCH ₃
[0110]	OC ₂ H ₅	<i>n</i> -C ₃ H ₇ O	<i>i</i> -C ₃ H ₇ O	<i>n</i> -C ₄ H ₉ O
	<i>s</i> -C ₄ H ₉ O	<i>i</i> -C ₄ H ₉ O	<i>t</i> -C ₄ H ₉ O	OCF ₃
	OCH ₂ CF ₃			
	CR₃R₄			
				

[0111] 表4R₅ (R₆、R₇、R₈) 取代基

	R₅	R₅	R₅	R₅
	F	Cl	Br	I
[0112]	CN	NH ₂	NO ₂	CH ₃
	C ₂ H ₅	<i>n</i> -C ₃ H ₇	<i>i</i> -C ₃ H ₇	<i>n</i> -C ₄ H ₉
	<i>s</i> -C ₄ H ₉	<i>i</i> -C ₄ H ₉	<i>t</i> -C ₄ H ₉	CF ₃
	CCl ₃	CHF ₂	CH ₂ Cl	CHBr ₂
	CF ₂ Cl	CFCl ₂	CF ₃ CH ₂	CH(CH ₃)F
	CH(CH ₃)Cl	CH(CH ₃)Br	C(CH ₃) ₂ F	OCH ₃
	OC ₂ H ₅	<i>n</i> -C ₃ H ₇ O	<i>i</i> -C ₃ H ₇ O	<i>n</i> -C ₄ H ₉ O
	<i>s</i> -C ₄ H ₉ O	<i>i</i> -C ₄ H ₉ O	<i>t</i> -C ₄ H ₉ O	OCF ₃
	OCH ₂ CF ₃	COOCH ₃	NH ₂ CO	CH ₃ NHCO
	C ₂ H ₅ NHCO	(CH ₃) ₂ NCO	Ph	Ph-4-Cl
[0113]	SCH ₃	SCF ₃	NHCH ₃	N(CH ₃) ₂
	COCH ₃	COC ₂ H ₅	SO ₂ CH ₃	OCHF ₂
	SO ₂ C ₂ H ₅	CO ₂ C ₂ H ₅	CH ₂ OCH ₃	OCOCH ₃
	-OCOCH ₂ CH ₃	OCO ₂ CH ₃	OCH ₂ OCH ₃	OCF ₂ OCF ₃
	COPh	COCH ₂ Ph	NHPh	OPh
	CONHPh	CO ₂ Ph	CF(CF ₃) ₂	SO ₂ NH ₂
				

[0114] 表5R₉取代基

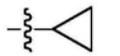
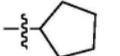
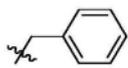
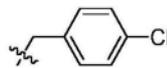
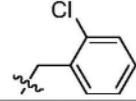
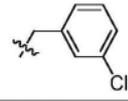
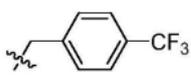
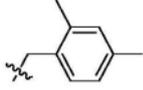
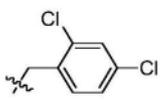
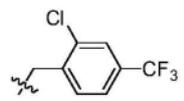
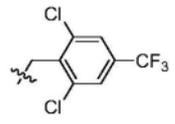
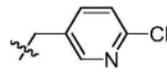
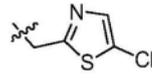
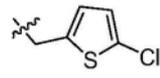
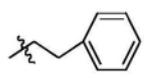
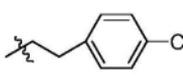
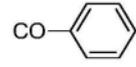
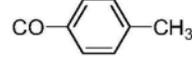
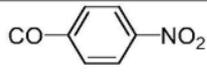
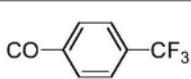
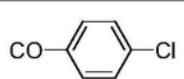
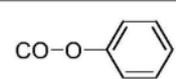
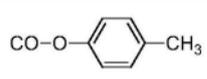
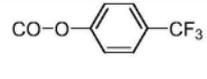
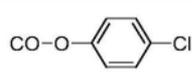
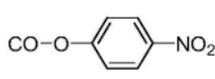
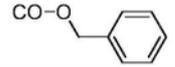
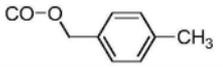
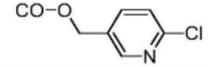
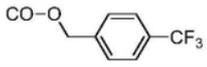
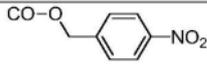
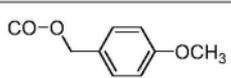
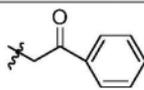
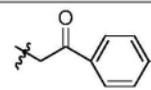
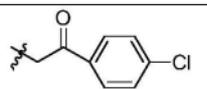
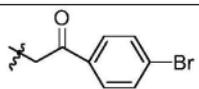
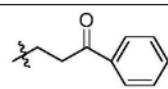
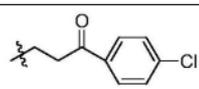
	R₈	R₈	R₈	R₈
	F	Cl	Br	I
	CN	NH ₂	NO ₂	CH ₃
	C ₂ H ₅	<i>n</i> -C ₃ H ₇	<i>i</i> -C ₃ H ₇	<i>n</i> -C ₄ H ₉
	<i>s</i> -C ₄ H ₉	<i>i</i> -C ₄ H ₉	<i>t</i> -C ₄ H ₉	CF ₃
	CCl ₃	CHF ₂	CH ₂ Cl	CHBr ₂
	CF ₂ Cl	CFCl ₂	CF ₃ CH ₂	CH(CH ₃)F
[0115]	CH(CH ₃)Cl	CH(CH ₃)Br	C(CH ₃) ₂ F	OCH ₃
	OC ₂ H ₅	<i>n</i> -C ₃ H ₇ O	<i>i</i> -C ₃ H ₇ O	<i>n</i> -C ₄ H ₉ O
	<i>s</i> -C ₄ H ₉ O	<i>i</i> -C ₄ H ₉ O	<i>t</i> -C ₄ H ₉ O	OCF ₃
	OCH ₂ CF ₃	COOCH ₃	NH ₂ CO	CH ₃ NHCO
	C ₂ H ₅ NHCO	(CH ₃) ₂ NCO	Ph	Ph-4-Cl
				

[0116] 表6R₁₀取代基

[0117]

R_3	R_3	R_3	R_3
H	OH	-C(=O)H	CBr ₃
CH ₃	C ₂ H ₅	<i>n</i> -C ₃ H ₇	<i>i</i> -C ₃ H ₇
<i>n</i> -C ₄ H ₉	<i>i</i> -C ₄ H ₉	<i>t</i> -C ₄ H ₉	CCl ₃
CH ₂ Br	CHF ₂	CHBr ₂	CF ₃
CH ₂ Cl	CHCl ₂	CCl ₃	CH ₂ F
OCH ₃	OC ₂ H ₅	OCH(CH ₃) ₂	OC(CH ₃) ₃
OCF ₃	OCH ₂ CF ₃	OCH ₂ F	OCHF ₂
SCH ₃	SC ₂ H ₅	SCH ₂ CH=CH ₂	CH=CH ₂
CH ₂ CH=CH ₂	CH ₂ CH=CCl ₂	C≡CH	CH ₂ C≡CH
CH ₂ C≡C-I	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ OCH ₂ Cl	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ C ₁	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ Cl
CH ₂ SCH ₃	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃
CH ₂ SCH ₂ Cl	CH ₂ SCH ₂ CH ₂ Cl	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ Cl	SOCH ₃
SOC ₂ H ₅	SOCF ₃	SOCH ₂ CF ₃	SO ₂ CH ₃

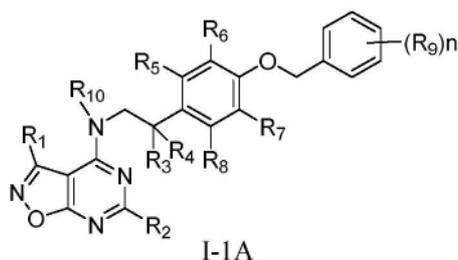
[0118]

$\text{SO}_2\text{C}_2\text{H}_5$	SO_2CF_3	$\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$	$\text{SO}_2\text{NHCOCH}_3$
SO_2NHCH_3	$\text{SO}_2\text{N}(\text{CH}_3)_3$	$\text{CONHSO}_2\text{CH}_3$	COCH_3
COC_2H_5	$\text{CO-}n\text{-C}_3\text{H}_7$	$\text{CO-}i\text{-C}_3\text{H}_7$	$\text{CO-}n\text{-C}_4\text{H}_9$
$\text{CO-}i\text{-C}_4\text{H}_9$	$\text{CO-}t\text{-C}_4\text{H}_9$	COCF_3	COCH_2Cl
COOCH_3	COOC_2H_5	$\text{COO-}n\text{-C}_3\text{H}_7$	$\text{COO-}t\text{-C}_4\text{H}_9$
COOCF_3	$\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	$\text{COOCH}_2\text{CF}_3$	$\text{CH}_2\text{COOCH}_3$
$\text{CH}_2\text{COOC}_2\text{H}_5$	CH_2COCH_3	$\text{CH}_2\text{COC}_2\text{H}_5$	CONHCH_3
CONHC_2H_5	$\text{CONH-}t\text{-C}_4\text{H}_9$	$\text{CON}(\text{CH}_3)_2$	$\text{CON}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$
$\text{COOCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	$\text{COOCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$\text{COOCH}_2\text{OCH}_3$	$\text{COOCH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_3$
SNHCH_3	SNHC_2H_5	$\text{SN}(\text{CH}_3)_2$	$\text{SN}(\text{C}_2\text{H}_5)_2$
			
CO-O- 	CO-O- 	CO-O- 	CO-O- 
			
			
			
		CO- 	CO- 
CO- 	CO- 	CO- 	CO-O- 
CO-O- 	CO-O- 	CO-O- 	CO-O- 
CO-O- 	CO-O- 	CO-O- 	CO-O- 
CO-O- 	CO-O- 		
			

[0119] 本发明的部分化合物可以用表7—表87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-1A、I-1B、I-1C、I-1D、I-2A、I-2B、I-2C、I-3A、I-3B、I-4A、I-5A或I-5B中, $R_2=R_3=R_4=R_5=R_6=R_7=R_8=R_{10}=\text{H}$ 。

[0120] 通式I-1A中,

[0121]

[0122] 当 $R_1 = \text{CH}_3$ 时, $(R_9)_n$ 取代基见表7, 代表化合物编号依次为7-1—7-279。

[0123] 表7

[0124]

序号	$(R_9)_n$	序号	$(R_9)_n$	序号	$(R_9)_n$
7-1	H	7-2	2-F	7-3	3-F
7-4	4-F	7-5	2,3-2F	7-6	2,4-2F
7-7	2,5-2F	7-8	2,6-2F	7-9	3,4-2F
7-10	3,5-2F	7-11	2,3,4-3F	7-12	2,3,5-3F
7-13	2,4,5-3F	7-14	2,3,6-3F	7-15	2,4,6-3F
7-16	3,4,5-3F	7-17	2-Cl	7-18	3-Cl
7-19	4-Cl	7-20	2,3-2Cl	7-21	2,4-2Cl
7-22	2,5-2Cl	7-23	2,6-2Cl	7-24	3,4-2Cl
7-25	3,5-2Cl	7-26	2,3,4-3Cl	7-27	2,3,5-3Cl
7-28	2,4,5-3Cl	7-29	2,3,6-3Cl	7-30	2,4,6-3Cl
7-31	3,4,5-3Cl	7-32	2-Br	7-33	3-Br
7-34	4-Br	7-35	2,3-Br	7-36	2,4-2Br
7-37	2,5-2Br	7-38	2,6-2Br	7-39	3,4-2Br
7-40	3,5-2Br	7-41	2,3,4-3Br	7-42	2,3,5-3Br
7-43	2,4,5-3Br	7-44	2,3,6-3Br	7-45	2,4,6-3Br
7-46	3,4,5-3Br	7-47	2-CN	7-48	3-CN
7-49	4-CN	7-50	2-NO ₂	7-51	3-NO ₂
7-52	4-NO ₂	7-53	2,4-2NO ₂	7-54	2,4,6-3NO ₂
7-55	2-CH ₃	7-56	3-CH ₃	7-57	4-CH ₃
7-58	2,3-2CH ₃	7-59	2,4-2CH ₃	7-60	2,5-2CH ₃
7-61	2,6-2CH ₃	7-62	3,4-2CH ₃	7-63	3,5-2CH ₃
7-64	2-C ₂ H ₅	7-65	3-C ₂ H ₅	7-66	4-C ₂ H ₅
7-67	2-CF ₃	7-68	3-CF ₃	7-69	4-CF ₃
7-70	2-OCH ₃	7-71	3-OCH ₃	7-72	4-OCH ₃
7-73	2-SCH ₃	7-74	3-SCH ₃	7-75	4-SCH ₃
7-76	2-OCF ₃	7-77	3-OCF ₃	7-78	4-OCF ₃
7-79	2-SCF ₃	7-80	3-SCF ₃	7-81	4-SCF ₃
7-82	2-OC ₂ H ₅	7-83	3-OC ₂ H ₅	7-84	4-OC ₂ H ₅
7-85	2-NHCH ₃	7-86	3-NHCH ₃	7-87	4-NHCH ₃
7-88	2-N(CH ₃) ₂	7-89	3-N(CH ₃) ₂	7-90	4-N(CH ₃) ₂
7-91	2-COCH ₃	7-92	3-COCH ₃	7-93	4-COCH ₃
7-94	2-COC ₂ H ₅	7-95	3-COC ₂ H ₅	7-96	4-COC ₂ H ₅
7-97	2-SO ₂ CH ₃	7-98	3-SO ₂ CH ₃	7-99	4-SO ₂ CH ₃
7-100	2-OCHF ₂	7-101	3-OCHF ₂	7-102	4-OCHF ₂
7-103	2-SO ₂ C ₂ H ₅	7-104	3-SO ₂ C ₂ H ₅	7-105	4-SO ₂ C ₂ H ₅
7-106	2-CO ₂ CH ₃	7-107	3-CO ₂ CH ₃	7-108	4-CO ₂ CH ₃
7-109	2-CO ₂ C ₂ H ₅	7-110	3-CO ₂ C ₂ H ₅	7-111	4-CO ₂ C ₂ H ₅
7-112	2-CH ₂ OCH ₃	7-113	3-CH ₂ OCH ₃	7-114	4-CH ₂ OCH ₃
7-115	2-OCOCH ₃	7-116	3-OCOCH ₃	7-117	4-OCOCH ₃
7-118	2-OCOCH ₂ CH ₃	7-119	3-OCOCH ₂ CH ₃	7-120	4-OCOCH ₂ CH ₃
7-121	2-OCO ₂ CH ₃	7-122	3-OCO ₂ CH ₃	7-123	4-OCO ₂ CH ₃
7-124	2-OCH ₂ OCH ₃	7-125	3-OCH ₂ OCH ₃	7-126	4-OCH ₂ OCH ₃

7-127	2-OCF ₂ OCF ₃	7-128	3-OCF ₂ OCF ₃	7-129	4-OCF ₂ OCF ₃
7-130	2-COPh	7-131	3-COPh	7-132	4-COPh
7-133	2-COCH ₂ Ph	7-134	3-COCH ₂ Ph	7-135	4-COCH ₂ Ph
7-136	2-NHPh	7-137	3-NHPh	7-138	4-NHPh
7-139	2-OPh	7-140	3-OPh	7-141	4-OPh
7-142	2-CONHPh	7-143	3-CONHPh	7-144	4-CONHPh
7-145	2-CO ₂ Ph	7-146	3-CO ₂ Ph	7-147	4-CO ₂ Ph
7-148	2-CONH ₂	7-149	3-CONH ₂	7-150	4-CONH ₂
7-151	2-Cl-4-F	7-152	2-Cl-4-Br	7-153	2-Cl-4-CH ₃
7-154	2-Cl-4-CF ₃	7-155	2-Cl-4-NO ₂	7-156	2-Cl-4-CN
7-157	2-Cl-4-OCF ₃	7-158	2-F-4-Cl	7-159	2-Br-4-Cl
7-160	2-CH ₃ -4-Cl	7-161	2-CF ₃ -4-Cl	7-162	2-NO ₂ -4-Cl
7-163	2-CN-4-Cl	7-164	2-OCF ₃ -4-Cl	7-165	2,6-2Cl-4-NO ₂
7-166	2,6-2Cl-4-CF ₃	7-167	2,6-2Cl-4-CN	7-168	4-C(CH ₃) ₃
7-169	2,6-2Cl-4-CONH ₂	7-170	2,4-2Cl-6-NO ₂	7-171	2,4-2Cl-6-CN
7-172	2,4-2Cl-6-CF ₃	7-173	2,4-2F-6-NO ₂	7-174	2,6-2F-4-NO ₂
7-175	2-NO ₂ -4-F	7-176	2-NO ₂ -4-Br	7-177	2-NO ₂ -4-CF ₃
7-178	2-NO ₂ -4-CN	7-179	2-NO ₂ -4-COCH ₃	7-180	2-NO ₂ -4-CONH ₂
7-181	2-NO ₂ -4-CH ₃	7-182	2-NO ₂ -4-OCH ₃	7-183	2-NO ₂ -4-SCH ₃
7-184	2-NO ₂ -4-NCH ₃	7-185	2-F-4-NO ₂	7-186	2-Br-4-NO ₂
7-187	2-CF ₃ -4-NO ₂	7-188	2-CN-4-NO ₂	7-189	2-COCH ₃ -4-NO ₂
7-190	2-CONH ₂ -4-NO ₂	7-191	2-CH ₃ -4-NO ₂	7-192	2-Cl-4-F-6-NO ₂
7-193	2-Cl-4-Br-6-NO ₂	7-194	2-Cl-4-CH ₃ -6-NO ₂	7-195	2-Cl-4-CF ₃ -6-NO ₂
7-196	2-Cl-4,6-2NO ₂	7-197	2-Cl-4-CN-6-NO ₂	7-198	2-Cl-4-OCF ₃ -6-NO ₂
7-199	2-F-4-Cl-6-NO ₂	7-200	2-Br-4-Cl-6-NO ₂	7-201	2-CH ₃ -4-Cl-6-NO ₂
7-202	2-CF ₃ -4-Cl-6-NO ₂	7-203	4-Cl-2,6-2NO ₂	7-204	2-CF ₃ -4-CN
7-205	2-CN-4-CF ₃	7-206	4-CF ₃ -2,6-2NO ₂	7-207	4-CN-2,6-2NO ₂
7-208	4-CH ₃ -2,6-2NO ₂	7-209	4-OCF ₃ -2,6-2NO ₂	7-210	4-OCH ₃ -2,6-2NO ₂
7-211	4-SCH ₃ -2,6-2NO ₂	7-212	4-NHCH ₃ -2,6-2NO ₂	7-213	4-F-2,6-2NO ₂
7-214	2-CF ₃ -4,6-2NO ₂	7-215	2-CN-4,6-2NO ₂	7-216	2-CH ₃ -4,6-2NO ₂
7-217	2-F-4,6-2NO ₂	7-218	2-OCF ₃ -4,6-2NO ₂	7-219	2-CF ₃ -4-Br
7-220	3-CF ₃ -4-NO ₂	7-221	2-CN-4-Cl-6-NO ₂	7-222	2-OCF ₃ -4-Cl-6-NO ₂
7-223	3-CF ₃ -4-CN	7-224	3-CN-4-CF ₃	7-225	2-CF ₃ -4-Br-6-NO ₂
7-226	3-NO ₂ -4-CF ₃	7-227	2-NO ₂ -4-CN-5-CF ₃	7-228	2-NO ₂ -4-CF ₃ -5-CN
7-229	4-OCF ₃ -2,6-2Br	7-230	2-F-6-Cl	7-231	2,4-2Cl-3-CH ₃
7-232	2,4-2Cl-3-CH ₃ -6-NO ₂	7-233	2-Cl-3-CH ₃	7-234	2-CH ₃ -3-Cl
7-235	2-CH ₃ -3-Cl-4,6-2NO ₂	7-236	2-CH ₃ -3-Cl-4-NO ₂	7-237	2-CH ₃ -3-Cl-6-NO ₂
7-238	2-Cl-3-CH ₃ -4,6-2NO ₂	7-239	2-Cl-3-CH ₃ -4-NO ₂	7-240	2-Cl-3-CH ₃ -6-NO ₂
7-241	2-Br-4-NO ₂ -6-CN	7-242	3-Cl-4-CF ₃ -2,6-2NO ₂	7-243	2NO ₂ -4,5-2Cl
7-244	2-NO ₂ -3,5-2Cl	7-245	2,5-2Cl-4-NO ₂	7-246	2,5-2Cl-6-NO ₂
7-247	2,3-2Cl-4-NO ₂	7-248	2,3-2Cl-6-NO ₂	7-249	3,4-2Cl-2,6-2NO ₂
7-250	2,5-2Cl-4,6-2NO ₂	7-251	2,4,5-3Cl-6-NO ₂	7-252	2,3,4-3Cl-5-NO ₂
7-253	2,3,4-3Cl-6-NO ₂	7-254	2,3,5-3Cl-4,6-2CN	7-255	2,5-2Cl-4-OCF ₂ OCF ₃
7-256	2,6-2Br-4-NO ₂	7-257	2-F-4-NO ₂ -6-Cl	7-258	2-Cl-4-NO ₂ -6-SCN
7-259	2-Br-4-NO ₂ -6-Cl	7-260	2-Cl-4-NO ₂ -6-OCH ₃	7-261	2-Cl-4-NO ₂ -6-SCH ₃
7-262	2-Cl-4-NO ₂ -6-NHCH ₃	7-263	2-Cl-4-NO ₂ -6-SO ₂ CH ₃	7-264	2-Cl-4-SO ₂ CH ₃
7-265	2,6-2Cl-4-SO ₂ CH ₃	7-266	2,6-2Cl-4-CH ₃	7-267	2,6-2Cl-4-CO ₂ CH ₃
7-268	2,6-2Cl-4-CONHCH ₃	7-269	2,6-2Cl-4-CON(CH ₃) ₂	7-270	2,6-2Cl-4-CF(CF ₃) ₂
7-271	2-Cl-4-CF(CF ₃) ₂ -6-Br	7-272	2-F-4-CF(CF ₃) ₂ -6-Br	7-273	2-F-4-CF(CF ₃) ₂ -6-Cl
7-274	2,6-2F-4-CF(CF ₃) ₂ -6-Cl	7-275	2,4,5-3Cl-3,6-2CN	7-276	2,3,5-3F-4,6-2CN
7-277	2-SO ₂ NH ₂	7-278	3-SO ₂ NH ₂	7-279	4-SO ₂ NH ₂

[0126] 表8:通式I-1A中,当R₁=H时,取代基(R₉)_n与表7一致,代表化合物编号依次为8-1—8-279。

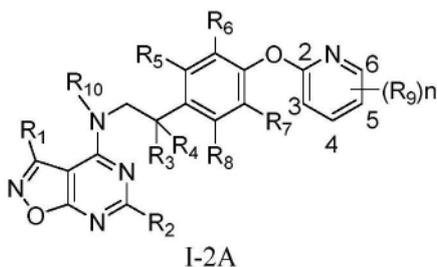
[0127] 表9:通式I-1A中,当R₁=C₂H₅时,取代基(R₉)_n与表7一致,代表化合物编号依次为9-1—9-279。

[0128] 表10:通式I-1A中,当R₁=i-C₃H₇时,取代基(R₉)_n与表7一致,代表化合物编号依次为10-1—10-279。

[0129] 表11:通式I-1A中,当R₁=n-C₄H₉时,取代基(R₉)_n与表7一致,代表化合物编号依次为11-1—11-279。

- [0130] 表12:通式I-1A中,当 $R_1=C_6H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为12-1—12-279。
- [0131] 表13:通式I-1B中,当 $R_1=CH_3$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为13-1—13-279。
- [0132] 表14:通式I-1B中,当 $R_1=H$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为14-1—14-279。
- [0133] 表15:通式I-1B中,当 $R_1=C_2H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为15-1—15-279。
- [0134] 表16:通式I-1B中,当 $R_1=i-C_3H_7$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为16-1—16-279。
- [0135] 表17:通式I-1B中,当 $R_1=n-C_4H_9$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为17-1—17-279。
- [0136] 表18:通式I-1B中,当 $R_1=C_6H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为18-1—18-279。
- [0137] 表19:通式I-1C中,当 $R_1=CH_3$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为19-1—19-279。
- [0138] 表20:通式I-1C中,当 $R_1=H$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为20-1—20-279。
- [0139] 表21:通式I-1C中,当 $R_1=C_2H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为21-1—21-279。
- [0140] 表22:通式I-1C中,当 $R_1=i-C_3H_7$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为22-1—22-279。
- [0141] 表23:通式I-1C中,当 $R_1=n-C_4H_9$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为23-1—23-279。
- [0142] 表24:通式I-1C中,当 $R_1=C_6H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为24-1—24-279。
- [0143] 表25:通式I-1D中,当 $R_1=CH_3$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为25-1—25-279。
- [0144] 表26:通式I-1D中,当 $R_1=H$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为26-1—26-279。
- [0145] 表27:通式I-1D中,当 $R_1=C_2H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为27-1—27-279。
- [0146] 表28:通式I-1D中,当 $R_1=i-C_3H_7$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为28-1—28-279。
- [0147] 表29:通式I-1D中,当 $R_1=n-C_4H_9$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为29-1—29-279。
- [0148] 表30:通式I-1D中,当 $R_1=C_6H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表7一致,代表化合物编号依次为30-1—30-279。
- [0149] 通式I-2A中,

[0150]

[0151] 当 $R_1 = \text{CH}_3$ 时, $(R_9)_n$ 取代基见表31,代表化合物编号依次为31-1—31-69。

[0152] 表31

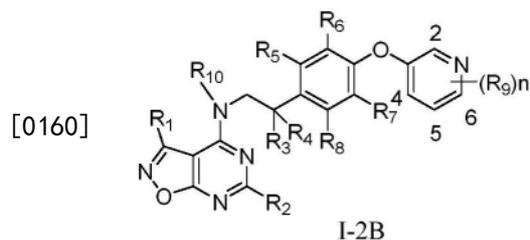
[0153]

No.	$(R_9)_n$	No.	$(R_9)_n$	No.	$(R_9)_n$
31-1	3-Cl	31-2	4-Cl	31-3	5-Cl
31-4	6-Cl	31-5	3-Br	31-6	4-Br
31-7	5-Br	31-8	6-Br	31-9	5-I
31-10	5-F	31-11	6-F	31-12	3- CH_2CH_3
31-13	4- CH_2CH_3	31-14	5- CH_2CH_3	31-15	6- CH_2CH_3
31-16	3- CF_3	31-17	4- CF_3	31-18	5- CF_3
31-19	6- CF_3	31-20	3-CN	31-21	4-CN
31-22	5-CN	31-23	6-CN	31-24	3- NO_2
31-25	5- NO_2	31-26	6- NO_2	31-27	5- OCH_3
31-28	6- OCH_3	31-29	3,5-2Cl	31-30	3,5-2Br
31-31	3,5,6-3Cl	31-32	3-Cl-5- CH_3	31-33	3-Cl-5- CF_3
31-34	3-Cl-5-CN	31-35	3-Br-5- NO_2	31-36	3-Br-5- CH_3
31-37	3- OCH_2Ph	31-38	3- CO_2CH_3	31-39	5- CO_2CH_3
31-40	5-Br-6- CH_3	31-41	5- CF_3 -6-Cl	31-42	3-CN-6-Cl
31-43	3- CH_3 -5-Br	31-44	3- NO_2 -5-Cl	31-45	3- NO_2 -5-Br
31-46	3- NO_2 -4- CH_3	31-47	3- CF_3 -6-Cl	31-48	3- CH_3 -5- NO_2
31-49	4- NO_2 -6- CH_3	31-50	4- CH_3 -5- NO_2	31-51	3- NO_2 -5- CH_3
31-52	5-CN-6- CH_3	31-53	5- NO_2 -6- CH_3	31-54	4- CH_3 -5-Br
31-55	5-CN-6- CF_3	31-56	3-CN-4,6-2Cl	31-57	3,5-2Br-6- CH_3
31-58	3-CN-4- CH_3 -6-Cl	31-59	3-CN-4- CF_3 -6-Cl	31-60	4- CH_3 -5-CN-6-Cl
31-61	4- CF_3 -5-CN-6-Cl	31-62	3- CO_2CH_3 -6-Cl	31-63	5- CO_2CH_3 -6-Cl
31-64	3,6-2Cl-5- CF_3	31-65	3- CONH_2 -4,6-2Cl	31-66	3-Br-4- CH_3 -5- NO_2
31-67	3,5-2Cl-6- OCH_3	31-68	3,5-2Cl-6- OCF_3	31-69	3,5-2Cl-6-(O Ph -4-Cl)

[0154] 表32:通式I-2A中,当 $R_1 = \text{H}$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表31一致,代表化合物编号依次为32-1—32-69。[0155] 表33:通式I-2A中,当 $R_1 = \text{C}_2\text{H}_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表31一致,代表化合物编号依次为33-1—33-69。[0156] 表34:通式I-2A中,当 $R_1 = i\text{-C}_3\text{H}_7$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表31一致,代表化合物编号依次为34-1—34-69。[0157] 表35:通式I-2A中,当 $R_1 = n\text{-C}_4\text{H}_9$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表31一致,代表化合物编号依次为35-1—35-69。

[0158] 表36:通式I-2A中,当 $R_1=C_6H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表31一致,代表化合物编号依次为36-1—36-69。

[0159] 通式I-2B中,



[0161] 当 $R_1=CH_3$ 时, $(R_9)_n$ 取代基见表37,代表化合物编号依次为37-1—37-33。

[0162] 表37

[0163]

No.	$(R_9)_n$	No.	$(R_9)_n$	No.	$(R_9)_n$
37-1	2-Cl	37-2	2-OCH ₃	37-3	2-Cl-4-CH ₃
37-4	4-Cl	37-5	6-OCH ₃	37-6	2-Cl-5-CH ₃
37-7	5-Cl	37-8	6-OPh	37-9	2-Cl-6-CH ₃
37-10	6-Cl	37-11	2,6-2Cl	37-12	4-CH ₂ CH ₃
37-13	2-Br	37-14	5,6-2Cl	37-15	4-CF ₃
37-16	6-Br	37-17	2,5-2Cl	37-18	6-CF ₃
37-19	4- <i>i</i> -C ₄ H ₉	37-20	6-Ph	37-21	6-OCH ₂ CF ₃
37-22	2,6-2Cl-4-CH ₃	37-23	2-OCH ₂ CF ₃	37-24	2-Cl-6-OCH ₃
37-25	2,6-2Cl-4-CF ₃	37-26	5-Cl-6-NHCH ₃	37-27	5-Cl-6-SO ₂ CH ₃
37-28	2,5-2Cl-6-SPh	37-29	2,5-2Cl-6-OPh	37-30	4-Br-6-OPh
37-31	2-OPh-6-Cl	37-32	3,5-2CH ₃ -4-Cl-6-OPh	37-33	

[0164] 表38:通式I-2B中,当 $R_1=H$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表37一致,代表化合物编号依次为38-1—38-33。

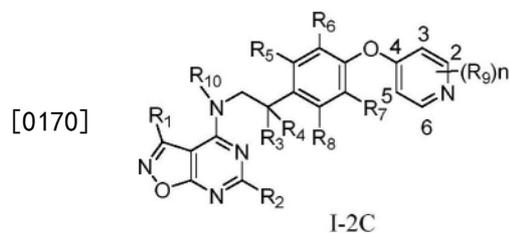
[0165] 表39:通式I-2B中,当 $R_1=C_2H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表37一致,代表化合物编号依次为39-1—39-33。

[0166] 表40:通式I-2B中,当 $R_1=i-C_3H_7$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表37一致,代表化合物编号依次为40-1—40-33。

[0167] 表41:通式I-2B中,当 $R_1=n-C_4H_9$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表37一致,代表化合物编号依次为41-1—41-33。

[0168] 表42:通式I-2B中,当 $R_1=C_6H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表37一致,代表化合物编号依次为42-1—42-33。

[0169] 通式I-2C中,



[0171] 当 $R_1=CH_3$ 时, $(R_9)_n$ 取代基见表43,代表化合物编号依次为43-1—43-11。

[0172] 表43

[0173]

No.	$(R_9)_n$	No.	$(R_9)_n$	No.	$(R_9)_n$
-----	-----------	-----	-----------	-----	-----------

43-1	2-Cl	43-2	3-Cl	43-3	2-OCH ₃
43-4	2-Br	43-5	2-I	43-6	2,6-2OCH ₃
43-7	2,6-2Cl	43-8	2-CN	43-9	2-NHCH ₃ -6-Cl
43-10	6-OPh	43-11	2-OCH ₃ -6-Cl		

[0174] 表44:通式I-2C中,当R₁=H时,取代基(R₉)_n与表43一致,代表化合物编号依次为44-1—44-11。

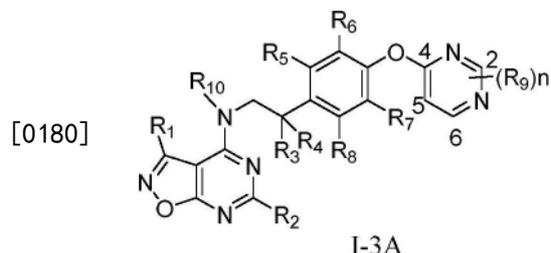
[0175] 表45:通式I-2C中,当R₁=C₂H₅时,取代基(R₉)_n与表43一致,代表化合物编号依次为45-1—45-11。

[0176] 表46:通式I-2C中,当R₁=i-C₃H₇时,取代基(R₉)_n与表43一致,代表化合物编号依次为46-1—46-11。

[0177] 表47:通式I-2C中,当R₁=n-C₄H₉时,取代基(R₉)_n与表43一致,代表化合物编号依次为47-1—47-11。

[0178] 表48:通式I-2C中,当R₁=C₆H₅时,取代基(R₉)_n与表43一致,代表化合物编号依次为48-1—48-11。

[0179] 通式I-3A中,



[0181] 当R₁=CH₃时,(R₉)_n取代基见表49,代表化合物编号依次为49-1—49-48。

[0182] 表49

[0183]

No.	(R ₉) _n	No.	(R ₉) _n	No.	(R ₉) _n
49-1	H	49-2	2-CN-6-CH ₃	49-3	2-SCH ₃ -6-CH ₃
49-4	6-C ₃ H ₇	49-5	2-SCH ₃ -5-Br	49-6	2-CN-5,6-2CH ₃
49-7	6-Cl	49-8	5-NH ₂ -6-Cl	49-9	2-PhNH-6-CF ₃
49-10	2-Cl	49-11	2-SCH ₃ -5-Cl	49-12	2-SO ₂ CH ₃ -6-CF ₃
49-13	6-OH	49-14	2-SCH ₃ -6-Cl	49-15	2-SO ₂ CH ₃ -6-CH ₃
49-16	5-CH ₃	49-17	2-Ph-4-CH ₃	49-18	2-CF ₃ -5,6-2CH ₃
49-19	2-NH ₂	49-20	2-NH ₂ -6-CH ₃	49-21	2-CF ₃ -5-CO ₂ C ₂ H ₅
49-22	2-Ph	49-23	6-Cl-2-PhCH ₂	49-24	2-CN-5-CH ₃ -6-Cl
49-25	2,6-2NH ₂	49-26	2-NH ₂ -6-CF ₃	49-27	2-SCH ₃ -5-OH-6-Cl
49-28	2-CN-6-Cl	49-29	2-NH ₂ -6-OCH ₃	49-30	2-(3-CH ₃ -Ph)-6-OH
49-31	2-CN-6-CF ₃	49-32	2-SCH ₃ -6-NH ₂	49-33	2-CONH ₂ -6-CH ₃
49-34	5-Cl-2-NH ₂	49-35	2-SCH ₃ -6-CF ₃	49-36	2-CONH ₂ -6-CF ₃
49-37	2-(Cyclopropyl)NH-6-CF ₃	49-38	2-(3,4-2Cl-Ph)NH-6-CF ₃	49-39	2-(4-Cl-Ph)NH-6-CF ₃
49-40	2-(2-Cl-Ph)NH-6-CF ₃	49-41	2-(2,4-2F-Ph)NH-6-CF ₃	49-42	2-(2,3,4-3Cl-Ph)NH-6-CF ₃
49-43	2-(2,3-2Cl-Ph)NH-6-CF ₃	49-44	2-(4-F-Ph)NH-6-CF ₃	49-45	2-(2,6-2Cl-Ph)NH-6-CF ₃
49-46	2-(2,4-2Cl-Ph)NH-6-CF ₃	49-47	2-(2-F-Ph)NH-6-CF ₃	49-48	2-(2,6-2F-Ph)NH-6-CF ₃

[0184] 表50:通式I-3A中,当R₁=H时,取代基(R₉)_n与表49一致,代表化合物编号依次为50-1—50-48。

[0185] 表51:通式I-3A中,当 $R_1=C_2H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表49一致,代表化合物编号依次为51-1—51-48。

[0186] 表52:通式I-3A中,当 $R_1=i-C_3H_7$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表49一致,代表化合物编号依次为52-1—52-48。

[0187] 表53:通式I-3A中,当 $R_1=n-C_4H_9$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表49一致,代表化合物编号依次为53-1—53-48。

[0188] 表54:通式I-3A中,当 $R_1=C_6H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表49一致,代表化合物编号依次为54-1—54-48。

[0189] 通式I-3B中,



[0191] 当 $R_1=CH_3$ 时, $(R_9)_n$ 取代基见表55,代表化合物编号依次为55-1—55-20。

[0192] 表55

[0193]

No.	$(R_9)_n$	No.	$(R_9)_n$	No.	$(R_9)_n$
55-1	H	55-2	4,6-2CH ₃	55-3	4-CO ₂ CH ₃
55-4	5-Br	55-5	4-thienyl	55-6	4,6-2OCH ₃
55-7	4-CH ₃	55-8	4,6-2Cl	55-9	4,5,6-3Cl
55-10	4-furyl	55-11	6-Ph	55-12	4-Cl-5-Br
55-13	4-(4-Cl-Ph)	55-14	4-NH ₂ -5-CN	55-15	4-CH ₃ -6-CO ₂ C ₂ H ₅
55-16	5-CO ₂ CH ₃	55-17	4-Cl-6-CH ₃	55-18	4-CF ₃ -5-CO ₂ CH ₃
55-19	4-CH ₃ -6-CO ₂ CH ₃	55-20	2-Pyridyl-5-Cl-6-CH ₃		

[0194] 表56:通式I-3B中,当 $R_1=H$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表55一致,代表化合物编号依次为56-1—56-20。

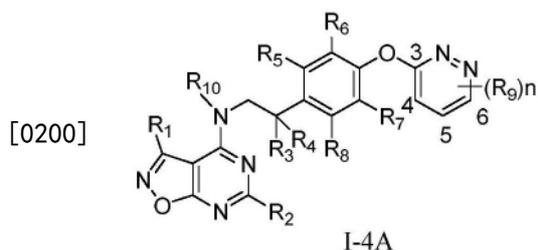
[0195] 表57:通式I-3B中,当 $R_1=C_2H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表55一致,代表化合物编号依次为57-1—57-20。

[0196] 表58:通式I-3B中,当 $R_1=i-C_3H_7$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表55一致,代表化合物编号依次为58-1—58-20。

[0197] 表59:通式I-3B中,当 $R_1=n-C_4H_9$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表55一致,代表化合物编号依次为59-1—59-20。

[0198] 表60:通式I-3B中,当 $R_1=C_6H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表55一致,代表化合物编号依次为60-1—60-20。

[0199] 通式I-4A中,



[0201] 当 $R_1 = \text{CH}_3$ 时, $(R_9)_n$ 取代基见表61,代表化合物编号依次为61-1—61-11。

[0202] 表61

[0203]

No.	$(R_9)_n$	No.	$(R_9)_n$	No.	$(R_9)_n$
61-1	H	61-2	6-Cl	61-3	6-Br
61-4	6- CH_3	61-5	6- NH_2	61-6	6- OCH_3
61-7	6- CF_3	61-8	6-OPh	61-9	6- SCH_3
61-10	4- CH_3 -6-Cl	61-11	6- NHCH_3		

[0204] 表62:通式I-4A中,当 $R_1 = \text{H}$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表61一致代表化合物编号依次为62-1—62-11。

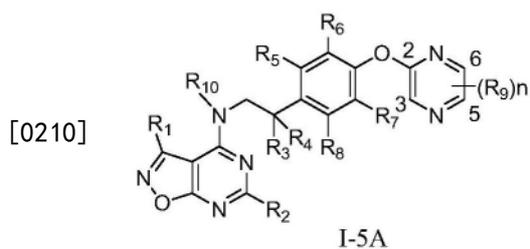
[0205] 表63:通式I-4A中,当 $R_1 = \text{C}_2\text{H}_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表61一致,代表化合物编号依次为63-1—63-11。

[0206] 表64:通式I-4A中,当 $R_1 = i\text{-C}_3\text{H}_7$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表61一致,代表化合物编号依次为64-1—64-11。

[0207] 表65:通式I-4A中,当 $R_1 = n\text{-C}_4\text{H}_9$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表61一致,代表化合物编号依次为65-1—65-11。

[0208] 表66:通式I-4A中,当 $R_1 = \text{C}_6\text{H}_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表61一致,代表化合物编号依次为66-1—66-11。

[0209] 通式I-5A中,



[0211] 当 $R_1 = \text{CH}_3$ 时, $(R_9)_n$ 取代基见表67,代表化合物编号依次为67-1—67-16。

[0212] 表67

[0213]

No.	$(R_9)_n$	No.	$(R_9)_n$	No.	$(R_9)_n$
67-1	H	67-2	5-Cl	67-3	6-Cl
67-4	5- NH_2	67-5	5-CN	67-6	6-CN
67-7	3-Cl	67-8	5- CH_3	67-9	6- OCH_3
67-10	5- OCH_3	67-11	5- SCH_3	67-12	6- SCH_3
67-13	6-OPh	67-14	5-OPh	67-15	5-SPh
67-16	5,6-($\text{CH}=\text{CCl}-\text{CH}=\text{CH}-$)				

[0214] 表68:通式I-5A中,当 $R_1 = \text{H}$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表67一致,代表化合物编号依次为

68-1—68-16。

[0215] 表69:通式I-5A中,当 $R_1=C_2H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表67一致,代表化合物编号依次为69-1—69-16。

[0216] 表70:通式I-5A中,当 $R_1=i-C_3H_7$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表67一致,代表化合物编号依次为70-1—70-16。

[0217] 表71:通式I-5A中,当 $R_1=n-C_4H_9$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表67一致,代表化合物编号依次为71-1—71-16。

[0218] 表72:通式I-5A中,当 $R_1=C_6H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表67一致,代表化合物编号依次为72-1—72-16。

[0219] 表73:通式I-5B中,当 $R_1=CH_3$ 时,取代基 $(R_8)_n$ 与表67一致,代表化合物编号依次为73-1—73-16。

[0220] 表74:通式I-5B中,当 $R_1=H$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表67一致代表化合物编号依次为74-1—74-16。

[0221] 表75:通式I-5B中,当 $R_1=C_2H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表67一致,代表化合物编号依次为75-1—75-16。

[0222] 表76:通式I-5B中,当 $R_1=i-C_3H_7$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表67一致,代表化合物编号依次为76-1—76-16。

[0223] 表77:通式I-5B中,当 $R_1=n-C_4H_9$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表67一致,代表化合物编号依次为77-1—77-16。

[0224] 表78:通式I-5B中,当 $R_1=C_6H_5$ 时,取代基 $(R_9)_n$ 与表67一致,代表化合物编号依次为78-1—78-16。

[0225] 通式I-1A中,当 $R_1=CH_3$ 、 $(R_9)_n=H$ 时,取代基 R_{10} (不为氢时)为不同的取代基见表79,代表化合物编号依次为79-1—79-140。

[0226] 表79

[0227]

No.	R ₁₀	No.	R ₁₀	No.	R ₁₀	No.	R ₁₀
79-1	S- <i>i</i> -C ₃ H ₇	79-2	OH	79-3	-C(=O)H	79-4	CBR ₃
79-5	CH ₃	79-6	C ₂ H ₅	79-7	<i>n</i> -C ₃ H ₇	79-8	<i>i</i> -C ₃ H ₇
79-9	<i>n</i> -C ₄ H ₉	79-10	<i>i</i> -C ₄ H ₉	79-11	<i>t</i> -C ₄ H ₉	79-12	Cl ₃
79-13	CH ₂ Br	79-14	CHF ₂	79-15	CHBr ₂	79-16	CF ₃
79-17	CH ₂ Cl	79-18	CHCl ₂	79-19	CCl ₃	79-20	CH ₂ F
79-21	OCH ₃	79-22	OC ₂ H ₅	79-23	OCH(CH ₃) ₂	79-24	OC(CH ₃) ₃
79-25	OCF ₃	79-26	OCH ₂ CF ₃	79-27	OCH ₂ F	79-28	OCHF ₂
79-29	SCH ₃	79-30	SC ₂ H ₅	79-31	SCH ₂ CH=CH ₂	79-32	CH=CH ₂
79-33	CH ₂ CH=CH ₂	79-34	CH ₂ CH=CCl ₂	79-35	C≡CH	79-36	CH ₂ C≡CH
79-37	CH ₂ C≡C-I	79-38	CH ₂ OCH ₃	79-39	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	79-40	CH ₂ CH ₂ OCH ₃
79-41	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	79-42	CH ₂ OCH ₂ Cl	79-43	CH ₂ OCH ₂ CH ₂ Cl	79-44	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ Cl
79-45	CH ₂ SCH ₃	79-46	CH ₂ SCH ₂ CH ₃	79-47	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	79-48	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₃
79-49	CH ₂ SCH ₂ Cl	79-50	CH ₂ SCH ₂ CH ₂ Cl	79-51	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ Cl	79-52	SOCH ₃
79-53	SOC ₂ H ₅	79-54	SOCF ₃	79-55	SOCH ₂ CF ₃	79-56	SO ₂ CH ₃
79-57	SO ₂ C ₂ H ₅	79-58	SO ₂ CF ₃	79-59	SO ₂ CH ₂ CF ₃	79-60	SO ₂ NHCOCH ₃
79-61	SO ₂ NHCH ₃	79-62	SO ₂ N(CH ₃) ₃	79-63	CONHSO ₂ CH ₃	79-64	COCH ₃
79-65	COC ₂ H ₅	79-66	CO- <i>n</i> -C ₃ H ₇	79-67	CO- <i>i</i> -C ₃ H ₇	79-68	CO- <i>n</i> -C ₄ H ₉
79-69	CO- <i>i</i> -C ₄ H ₉	79-70	CO- <i>t</i> -C ₄ H ₉	79-71	COCF ₃	79-72	COCH ₂ Cl
79-73	COOCH ₃	79-74	COOC ₂ H ₅	79-75	COO- <i>n</i> -C ₃ H ₇	79-76	COO- <i>t</i> -C ₄ H ₉
79-77	COOCF ₃	79-78	COOCH ₂ CH ₂ Cl	79-79	COOCH ₂ CF ₃	79-80	CH ₂ COOCH ₃
79-81	CH ₂ COOC ₂ H ₅	79-82	CH ₂ COCH ₃	79-83	CH ₂ COC ₂ H ₅	79-84	CONHCH ₃
79-85	CONHC ₂ H ₅	79-86	CONH- <i>t</i> -C ₄ H ₉	79-87	CON(CH ₃) ₂	79-88	CON(C ₂ H ₅) ₂
79-89	COOCH ₂ CH=CH ₂	79-90	COOCH ₂ C≡CH	79-91	COOCH ₂ OCH ₃	79-92	COOCH ₂ CH ₂ OCH ₃
79-93	SNHCH ₃	79-94	SNHC ₂ H ₅	79-95	SN(CH ₃) ₂	79-96	SN(C ₂ H ₅) ₂
79-97		79-98		79-99		79-100	
79-101	CO-O- 	79-102	CO-O- 	79-103	CO-O- 	79-104	CO-O- 

[0228]

79-105		79-106		79-107		79-108	
79-118		79-110		79-111		79-112	
79-113		79-114		79-115		79-116	
79-117		79-118		79-119		79-120	
79-121		79-122		79-123		79-124	
79-125		79-126		79-127		79-128	
79-129		79-130		79-131		79-132	
79-133		79-134		79-135		79-136	
79-137		79-138		79-139		79-140	

[0229] 表80:通式I-1A中,当 $R_1=CH_3$ 、 $(R_9)_n=2-C1$ 时,取代基 R_{10} 与表79一致,代表化合物编号依次为80-1—80-140。

[0230] 表81:通式I-1A中,当 $R_1=CH_3$ 、 $(R_9)_n=4-C1$ 时,取代基 R_{10} 与表79一致,代表化合物编号依次为81-1—81-140。

[0231] 表82:通式I-1A中,当 $R_1=CH_3$ 、 $(R_9)_n=2,4-2C1$ 时,取代基 R_{10} 与表79一致,代表化合物编号依次为82-1—82-140。

[0232] 表83:通式I-1A中,当 $R_1=CH_3$ 、 $(R_9)_n=2,5-2CH_3$ 时,取代基 R_{10} 与表79一致,代表化合物编号依次为83-1—83-140。

[0233] 表84:通式I-1A中,当 $R_1=CH_3$ 、 $(R_9)_n=2,6-2F$ 时,取代基 R_{10} 与表79一致,代表化合物编号依次为84-1—84-140。

[0234] 表85:通式I-1A中,当 $R_1=CH_3$ 、 $(R_9)_n=2-CH_3$ 时,取代基 R_{10} 与表79一致,代表化合物编号依次为85-1—85-140。

[0235] 表86:通式I-1A中,当 $R_1=CH_3$ 、 $(R_9)_n=4-CH_3$ 时,取代基 R_{10} 与表79一致,代表化合物编号依次为86-1—86-140。

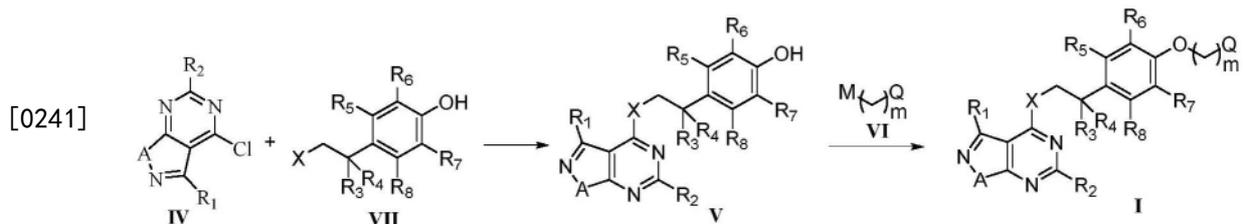
[0236] 本发明的部分化合物的盐可以用表87中列出的具体化合物的盐来说明,但并不限定本发明。

[0237] 表87部分化合物盐

No.	structure	No.	structure
87-1		87-2	
87-3		87-4	
87-5		87-6	
[0238] 87-7		87-8	
87-9		87-10	
87-11		87-12	
87-13		87-14	

[0239] 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:

[0240] 通式化合物I的制备采用如下方法:



[0242] 通式VI中,M是离去基团,选自氯或溴;其他各基团的定义同上。

[0243] 中间体IV与中间体VII在碱性条件下于适宜的溶剂中反应生成中间体V,然后与中

中间体VI在碱性条件下于适宜的溶剂中反应得到通式I化合物。

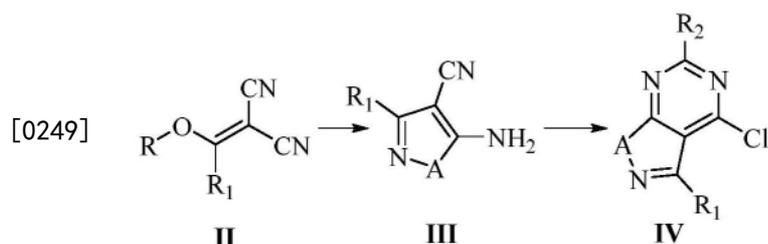
[0244] 上述两步反应过程中适宜的碱可相同或不同的选自如氢氧化钾、氢氧化钠、碳酸钠、碳酸钾、碳酸氢钠、三乙胺、吡啶、甲醇钠、乙醇钠、氢化钠、叔丁醇钾或叔丁醇钠等。

[0245] 上述两步反应过程中适宜的溶剂可相同或不同的选自如四氢呋喃、1,4-二氧六环、乙腈、甲苯、二甲苯、苯、N,N-二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯烷酮、二甲亚砜、丙酮或丁酮等。

[0246] 两步反应温度均可在室温至适宜溶剂沸点温度之间,通常为20-100℃。

[0247] 两步反应时间为30分钟至20小时,通常1-10小时。

[0248] 中间体IV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:



[0250] 以II为原料合成中间体III,进一步合成中间体IV,参考如下文献:W02008057402、W02004087056等。

[0251] 中间体VI、VII均有市售。

[0252] 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含嘧啶并环类化合物,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。

[0253] 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。

[0254] 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。

[0255] 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、粟锈病、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、粟粒黑穗病、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。

[0256] 由于其积极的特性,上述化合物可有利地用于保护农业和园艺业重要的作物、家畜和种畜,以及人类常去的环境免于病菌的伤害。

[0257] 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。

[0258] 每公顷10克—5公斤的化合物剂量能提供充分的防治。

[0259] 本发明还包括以通式I所示化合物作为活性组分的杀菌组合物。该杀菌组合物中活性组分的重量百分含量在0.5-99%之间。该杀菌组合物中还包括农业、林业、卫生上可接受的载体。

[0260] 本发明的组合物可以制剂的形式施用。通式I所示化合物作为活性组分溶解或分散于载体中或配制成制剂以便作为杀菌使用时更易于分散。例如:这些化学制剂可被制成可湿性粉剂、油悬剂、水悬剂、水乳剂、水剂或乳油等。在这些组合物中,至少加入一种液体或固体载体,并且当需要时可以加入适当的表面活性剂。

[0261] 本发明的技术方案还包括防治病菌的方法:将本发明的杀菌组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。

[0262] 对于某些应用,例如在农业上可在本发明的杀菌组合物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。

[0263] 应明确的是,在本发明的权利要求所限定的范围内,可进行各种变换和改动。本发

明所具有的优点：本发明化合物结构新颖，具有广谱杀菌活性，特别对黄瓜霜霉病在6.25ppm防效80%以上，是一类极具优化价值的先导结构。

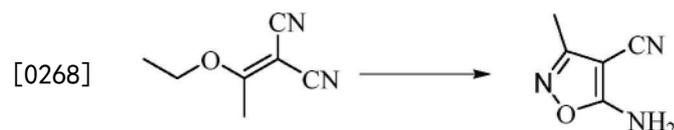
具体实施方式

[0264] 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)。

[0265] 合成实施例

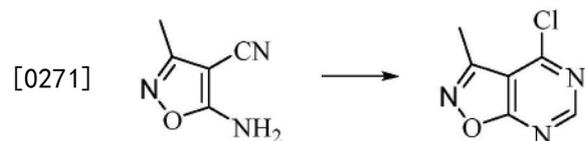
[0266] 实施例1：中间体2-((3-甲基异恶唑并[5,4-d]嘧啶-4-基)氨基)乙醇的制备

[0267] 1) 5-氨基-3-甲基异恶唑-4-氰基的制备



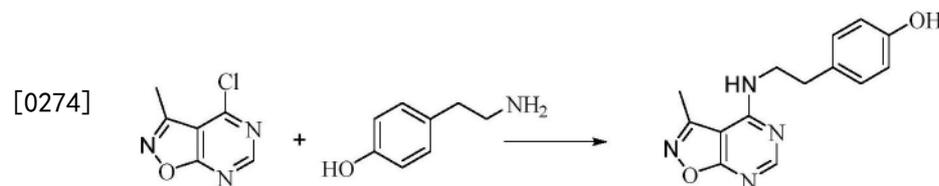
[0269] 将14g (0.2摩尔)的盐酸羟胺溶于80mL10%氢氧化钠中，加入27.2g (0.2摩尔) (1-乙氧基亚乙基)丙二腈，加入少量冰保持温度50℃以下，室温继续搅拌1.5小时，固体过滤，水洗，无水乙醇重结晶，得到固体产品16.5g。

[0270] 2) 4-氯-3-甲基异恶唑并[5,4-d]嘧啶的制备



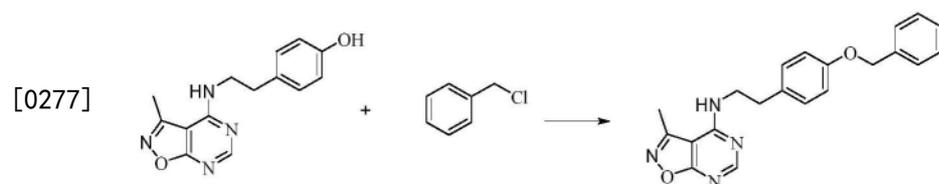
[0272] 将三氯氧磷(POCl_3) 40mL和N,N-二甲基甲酰胺1mL加入到反应瓶中，室温搅拌1小时，加入5-氨基-3-甲基异恶唑-4-氰基(451mg, 3.66mmol)，升温到160℃反应15-36小时，反应液减压蒸馏，得到淡黄色固体，熔点110.5℃。

[0273] 3) 4-(2-((3-甲基异恶唑并[5,4-d]嘧啶-4-基)氨基)乙基)苯酚的制备



[0275] 将1.69g (0.01mol) 4-氯-3-甲基异恶唑并[5,4-d]嘧啶和2.74g (0.02mol) 对羟基苯乙胺加入50ml四氢呋喃中，加入4.45g (0.022mol) 三乙胺，室温反应4-10小时，TLC监测反应完毕后，减压蒸除溶剂，加水析出固体，过滤得中间体。

[0276] 实施例2：化合物7-1的制备

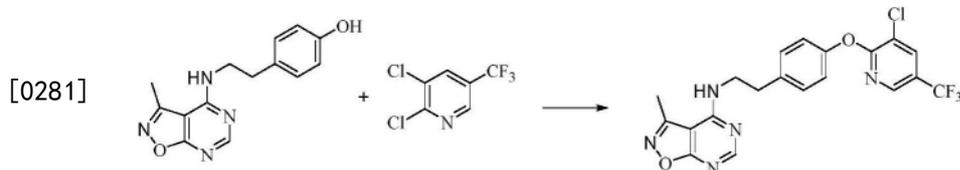


[0278] 将0.54g (2mmol) 4-(2-((3-甲基异恶唑并[5,4-d]嘧啶-4-基)氨基)乙基)苯酚和0.25g (2mmol) 氯化苄加入5毫升N,N-二甲基甲酰胺中，加入0.41g (3mmol) 碳酸钾，加热至80℃，反应4-10小时，TLC监测反应完毕后，将反应液倒入50毫升饱和食盐水中，用100毫升乙

酸乙酯分三次进行萃取,干燥。脱溶后,柱层析纯化得产品0.45克,即化合物7-1,熔点123.0℃。

[0279] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标TMS, 溶剂 CDCl_3) δ (ppm) : 8.50 (s, 1H) , 7.35-7.42 (m, 5H) , 7.15 (d, 2H) , 6.97 (d, 1H) , 5.16 (s, 1H) , 5.07 (s, 2H) , 3.87 (q, 2H) , 2.93 (t, 2H) , 2.37 (s, 3H) 。

[0280] 实施例3:化合物31-33的制备



[0282] 将60%氢化钠0.16g加入到反应瓶中,用石油醚洗后,加入5毫升N,N-二甲基甲酰胺,然后加入4-(2-((3-甲基异恶唑并[5,4-d]嘧啶-4-基)氨基)乙基)苯酚0.54g (2mmol) , 室温搅拌2分钟后加入中间体2,3-二氯-5-三氟甲基吡啶0.43g (2mmol) , 60℃下搅拌反应2小时。TLC监测反应完毕后,将反应液倒入50毫升饱和食盐水中,用100毫升乙酸乙酯分三次进行萃取,干燥。脱溶后,柱层析纯化得产品0.58克,即化合物31-33。熔点141.7℃。

[0283] $^1\text{H-NMR}$ (300MHz, 内标TMS, 溶剂 CDCl_3) δ (ppm) : 8.53 (s, 1H) , 8.25 (s, 1H) , 7.99 (s, 1H) , 7.32 (d, 2H) , 7.16 (d, 2H) , 5.25 (s, 1H) , 3.96 (q, 2H) , 3.05 (t, 2H) , 2.48 (s, 3H) 。

[0284] 本发明的其他化合物可以参照以上实施例制备。

[0285] 部分化合物的物性数据及核磁数据($^1\text{H-NMR}$, 300MHz, 内标TMS, ppm) 如下:

[0286] 化合物31-18:熔点132.2℃。 δ (CDCl_3) 8.53 (s, 1H) , 8.41 (d, 1H) , 7.92 (dd, 1H) , 7.30 (d, 2H) , 7.14 (dd, 2H) , 7.04 (d, 1H) , 5.30 (s, 1H) , 3.95 (q, 2H) , 3.04 (t, 2H) , 2.47 (s, 3H) 。

[0287] 化合物7-168:熔点115.0℃。 δ (CDCl_3) 8.51 (s, 1H) , 7.35-7.44 (dd, 4H) , 7.15 (d, 2H) , 6.97 (d, 1H) , 5.30 (s, 1H) , 5.03 (s, 2H) , 3.87 (q, 2H) , 2.93 (t, 2H) , 2.38 (s, 3H) , 1.33 (s, 9H) 。

[0288] 化合物31-22: δ (CDCl_3) 8.52 (s, 1H) , 8.44 (d, 1H) , 7.94 (dd, 1H) , 7.32 (d, 2H) , 7.13 (d, 2H) , 7.05 (d, 1H) , 5.30 (s, 1H) , 3.95 (q, 2H) , 3.04 (t, 2H) , 2.48 (s, 3H) 。

[0289] 化合物7-8:熔点155.6℃。 δ (CDCl_3) 8.51 (s, 1H) , 7.34 (m, 1H) , 7.16 (d, 2H) , 6.99 (d, 2H) , 6.94 (m, 2H) , 5.18 (s, 1H) , 5.12 (s, 2H) , 3.88 (q, 2H) , 2.95 (t, 2H) , 2.40 (s, 3H) 。

[0290] 化合物7-17:熔点163.7℃。 δ (CDCl_3) 8.50 (s, 1H) , 7.54 (m, 1H) , 7.40 (m, 1H) , 7.27 (m, 2H) , 7.16 (d, 2H) , 6.97 (d, 2H) , 5.17 (s, 3H) , 3.88 (q, 2H) , 2.94 (t, 2H) , 2.39 (s, 3H) 。

[0291] 化合物7-55:熔点148.9℃。 δ (CDCl_3) 8.51 (s, 1H) , 7.40 (m, 1H) , 7.25 (m, 1H) , 7.21 (m, 2H) , 7.15 (d, 2H) , 6.97 (d, 2H) , 5.17 (s, 1H) , 5.04 (s, 2H) , 3.88 (q, 2H) , 2.95 (t, 2H) , 2.39 (s, 3H) , 2.38 (s, 3H) 。

[0292] 化合物7-230:熔点158.3℃。 δ (CDCl_3) 8.51 (s, 1H) , 7.30 (m, 1H) , 7.25 (m, 1H) , 7.17 (d, 2H) , 7.05 (m, 1H) , 7.02 (d, 2H) , 5.18 (s, 3H) , 3.90 (q, 2H) , 2.95 (t, 2H) , 2.41 (s, 3H) 。

[0293] 化合物7-21:熔点157.1℃。 δ (CDCl_3) 8.51 (s, 1H) , 7.48 (m, 1H) , 7.43 (m, 1H) , 7.27 (m, 1H) , 7.18 (d, 2H) , 6.95 (d, 2H) , 5.17 (s, 1H) , 5.12 (s, 2H) , 3.88 (q, 2H) , 2.94 (t, 2H) , 2.41 (s, 3H) 。

[0294] 化合物7-60:熔点134.0℃。 δ (CDCl_3) 8.51 (s, 1H) , 7.22 (s, 1H) , 7.16 (d, 2H) , 7.09

(m, 2H), 6.98 (d, 2H), 5.17 (s, 1H), 4.99 (s, 2H), 3.90 (q, 2H), 2.95 (t, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.33 (s, 6H)。

[0295] 化合物82-111: 熔点146.7°C。δ (CDCl₃) 8.54 (s, 1H), 7.47 (m, 2H), 7.42 (m, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.22 (m, 1H), 7.12 (d, 2H), 7.05 (d, 1H), 6.89 (m, 2H), 5.10 (s, 2H), 4.79 (s, 2H), 3.89 (q, 2H), 2.97 (t, 2H), 2.34 (s, 3H)。

[0296] 化合物83-114: 熔点209.6°C。δ (CDCl₃) 8.55 (s, 1H), 7.22 (s, 1H), 7.10 (m, 4H), 7.05 (m, 2H), 6.91 (d, 2H), 6.80 (s, 1H), 4.97 (s, 2H), 4.60 (s, 2H), 3.86 (q, 2H), 2.98 (t, 2H), 2.32 (s, 6H), 2.27 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.12 (s, 3H)。

[0297] 按照上述制备方法的记载, 还可获得通式I所示的其它化合物。

[0298] 生物活性测定实施例

[0299] 本发明化合物对农业领域中的多种病菌都表现出很好的活性。

[0300] 实施例4: 杀菌活性测定

[0301] 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。

[0302] (1) 离体杀菌活性测定

[0303] 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。

[0304] 部分化合物的离体抑菌活性(以抑制率表示) 测试结果如下:

[0305] 对稻瘟病菌的抑制率:

[0306] 在25ppm剂量下, 化合物31-18、31-33等对稻瘟病的抑制率在80%以上;

[0307] (2) 活体保护活性测定

[0308] 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。

[0309] 部分化合物的活体保护活性测试结果如下:

[0310] 对黄瓜霜霉病的活体保护活性:

[0311] 在400ppm剂量下, 化合物7-1、7-8、7-17、7-55、7-168、7-230、31-18、31-22、31-33、83-114等对黄瓜霜霉病防效在80%以上的;

[0312] 在100ppm剂量下, 化合物7-1、7-8、7-17、7-55、7-230、31-18、31-22、31-33等对黄瓜霜霉病防效在80%以上的;

[0313] 在25ppm剂量下, 化合物7-1、7-8、31-18、31-22等对黄瓜霜霉病防效在80%以上的;

- [0314] 在6.25ppm剂量下,化合物7-1、31-18、31-22等对黄瓜霜霉病防效在80%以上的;
- [0315] 对小麦白粉病的活体保护活性:
- [0316] 在400ppm剂量下,化合物7-1、31-18、31-22、31-33等对小麦白粉病防效在80%以上的;
- [0317] 对玉米锈病的活体保护活性:
- [0318] 在400ppm剂量下,化合物7-1、7-8、7-17、7-55、31-18、31-22等对玉米锈病防效在80%以上的。
- [0319] 对黄瓜炭疽病的活体保护活性:
- [0320] 在400ppm剂量下,化合物7-1、7-8、7-17、7-55、7-168、7-230、31-18等对黄瓜炭疽病防效在80%以上的。
- [0321] 化合物7-1及对照药剂的测试结果(防效%)

化合物	黄瓜霜霉病	小麦白粉病	玉米锈病	黄瓜炭疽病
	6.25ppm	400ppm	400ppm	400ppm
7-1	100	100	100	80
CK	30	0	0	0