



(12) 发明专利申请

(10) 申请公布号 CN 115477615 A

(43) 申请公布日 2022.12.16

(21) 申请号 202211264973.7

A01N 43/56 (2006.01)

(22) 申请日 2022.10.17

A01P 7/04 (2006.01)

(71) 申请人 黄山学院

地址 245041 安徽省黄山市屯溪区西海路
39号

(72) 发明人 史建俊 李伟伟 吴潇然 汪燕

(74) 专利代理机构 杭州浙科专利事务所(普通
合伙) 33213

专利代理师 周红芳

(51) Int. Cl.

C07D 235/18 (2006.01)

C07D 405/12 (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01)

C07D 403/12 (2006.01)

A01N 43/52 (2006.01)

权利要求书3页 说明书23页

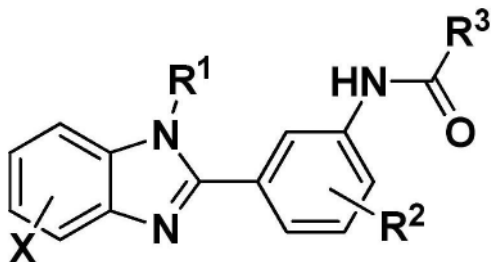
(54) 发明名称

N-(3-(苯并咪唑-2-基)苯基)酰胺类化合物
及其制备方法和应用

(57) 摘要

本发明公开了一种N-(3-(苯并咪唑-2-基)苯基)酰胺类化合物及其制备方法和应用,取代邻硝基氯苯和取代胺反应生成取代邻硝基苯胺,经铁粉还原为取代邻苯二胺,之后邻苯二胺与取代间硝基苯甲酸缩合生成取代苯并咪唑联苯,经铁粉还原为取代苯并咪唑基苯胺,之后苯并咪唑基苯胺与酰氯反应制得N-(3-(苯并咪唑-2-基)苯基)酰胺类化合物。本发明制备方法简单、操作方便,制得的61个新化合物都经过¹H NMR和MS表征,并在200 μg/mL的浓度下进行了杀虫活性测试,结果表明,大部分化合物具有一定的杀虫活性,其中部分化合物对粘虫致死率在85%以上,部分化合物对苜蓿蚜致死率在85%以上,部分化合物对稻飞虱致死率在85%以上。

1. N-(3-(苯并咪唑-2-基)苯基)酰胺类化合物,其特征在于其结构式如式(I)所示:



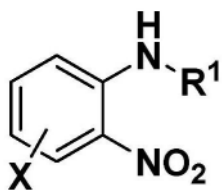
(I)

式(I)中,取代基X为多氟烷基、烷基、卤素、硝基或腈基,取代基R¹取代或不取代,取代时R¹为烷基、苯基或取代烷基,取代基R²取代或不取代,取代时R²为卤素、硝基、腈基、烷氧基、烷硫基、亚砷基或砷基,取代基R³为烷基、烷氧基、取代烷基、取代烷氧基、苯基、取代苯基、杂芳基或取代杂芳基,取代苯基和取代杂芳基上的取代基为烷基、烷氧基、卤素、硝基或腈基。

2. 根据权利要求1所述的N-(3-(苯并咪唑-2-基)苯基)酰胺类化合物,其特征在于取代基X为三氟甲基或七氟异丙基,取代基R¹取代或不取代,取代时R¹为甲基、乙基或环丙基,取代基R²取代或不取代,取代时R²为2-氯或4-氯,取代基R³为甲基、环己基、乙氧基、正丙氧基、正丁氧基、2-氯乙基、(2,3-二氟苯基)甲基、苄氧基、苯基、2-甲基苯基、3-甲基苯基、4-甲基苯基、4-叔丁基苯基、3-甲氧基苯基、4-甲氧基苯基、3-氟苯基、4-氟苯基、2-氯苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、2,6-二氟苯基、2,4-二氯苯基、2-三氟甲基苯基、2-硝基苯基、3-硝基苯基、4-氰基苯基、2-氯-3-硝基苯基、呋喃-2-基、吡啶-3-基、苯氧基、2-氯吡啶-3-基、6-氯吡啶-3-基或3-乙基-1,4-二甲基-1H-吡唑-5-基。

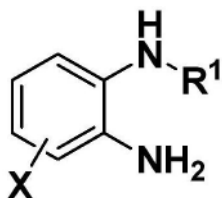
3. 一种根据权利要求1或2所述的N-(3-(苯并咪唑-2-基)苯基)酰胺类化合物的制备方法,其特征在于包括如下步骤:

1) 以二甲基甲酰胺为溶剂,将取代邻硝基氯苯和取代胺R¹NH₂室温下反应3-6h,TLC检测反应完全后停止反应,乙酸乙酯萃取,干燥,减压蒸发除去低沸点物得到如式(II)所示的化合物;



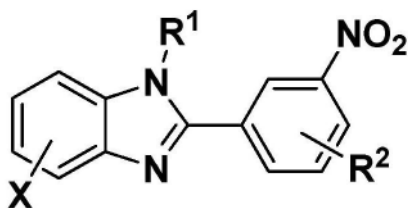
(II)

2) 向通过步骤1)得到的如式(II)所示化合物中加入乙醇水溶液、铁粉,滴加饱和氯化铵水溶液,回流反应2~4h,TLC检测反应完全后停止反应,过滤,乙酸乙酯萃取,干燥,减压蒸发除去低沸点物得到如式(III)所示的化合物;



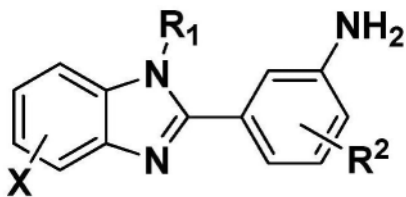
(III)

3) 向通过步骤2)得到的如式(III)所示化合物中加入取代间硝基苯甲酸和三氯氧磷,加热回流5~10h,检测反应完全,待反应液冷却至室温后将反应液缓慢倒入冰水中,混合物用乙酸乙酯萃取,干燥,减压蒸发除去低沸点物,经柱层析分离提纯得到如式(IV)所示的化合物;



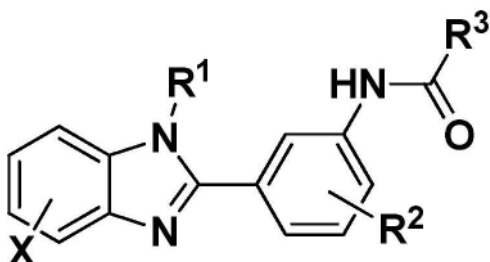
(IV)

4) 向通过步骤3)得到的如式(IV)所示化合物中加入乙醇水溶液、铁粉,滴加饱和氯化铵水溶液,回流反应4~8h,TLC检测反应完全后停止反应,过滤,乙酸乙酯萃取,干燥,减压蒸发除去低沸点物,经柱层析分离提纯得到式(V)所示的化合物;



(V)

5) 将通过步骤4)得到的如式(V)所示化合物溶解于干燥四氢呋喃中,加入三乙胺,在冰盐浴条件下滴加酰氯 R^3COCl ,TLC检测反应完全后停止反应,干燥,减压蒸发除去低沸点物,经柱层析分离提纯得到式(I)所示的化合物。



(I)

4. 根据权利要求3所述的制备方法,其特征在于步骤1)中,所述取代邻硝基氯苯和取代 R^1NH_2 的物质的量比为1:1~1:2.5;步骤2)中,式(II)所示化合物和铁粉的物质的量比为1:2~1:3;步骤3)中,式(III)所示化合物、取代间硝基苯甲酸和三氯氧磷的物质的量比为1:1~1.5:3~8;步骤4)中,式(IV)所示化合物和铁粉的物质的量比为1:2~1:3;步骤5)中,式

(V)所示化合物、酰氯 R^3COCl 和三乙胺的物质的量比为1:1~1.5:1.2~2。

5. 根据权利要求3所述的制备方法,其特征在于步骤1)中溶解取代邻硝基氯苯的二甲基甲酰胺的体积用量以取代邻硝基氯苯的物质的量记为0.5~3mL/mmol,步骤2)中溶解式(II)所示化合物的乙醇水溶液的体积用量以式(II)所示化合物的物质的量记为2~10mL/mmol,乙醇水溶液中乙醇和水的体积比为2~8:1,溶解式(V)所示化合物的四氢呋喃的体积用量以式(V)所示化合物的物质的量记为2~6mL/mmol。

6. 根据权利要求3所述的制备方法,其特征在于步骤4)中滴加饱和氯化铵水溶液的体积用量以式(IV)所示化合物的物质的量记为0.2~2mL/mmol。

7. 根据权利要求3所述的制备方法,其特征在于步骤5)中柱层析分离的洗脱剂均采用体积比3:1的石油醚和乙酸乙酯混合液。

8. 根据权利要求3所述的制备方法,其特征在于步骤3)中反应液冷却至室温后,反应液倒入冰水中的速率为倒入冰水中的速率为1~5mL/min。

9. 一种根据权利要求1或2所述的N-(3-(苯并咪唑-2-基)苯基)酰胺类化合物在制备杀虫剂中的应用。

N- (3- (苯并咪唑-2-基) 苯基) 酰胺类化合物及其制备方法和应用

技术领域

[0001] 本发明属于化学合成与药物应用技术领域,具体涉及一种N- (3- (苯并咪唑-2-基) 苯基) 酰胺类化合物及其制备方法和应用。

背景技术

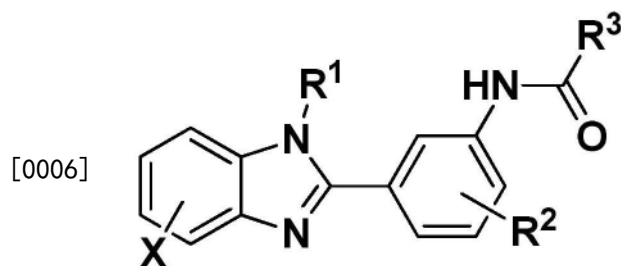
[0002] 随着对农药的认识,使用和开发技术不断的成熟,以及对有害生物科学治理理论的发展,环境友好型农药将会逐步取代高毒,高残留的农药。

[0003] 苯并咪唑作为一类苯并杂环类化合物,具有两个N原子的特殊结构,因而易于与生物体内酶和作用位点间形成氢键。苯并咪唑及其衍生物表现出广泛的生物活性,如抗病毒、抗凝血、抑菌、杀虫等活性。一些多氟烷基基团逐渐被引入农药先导化合物结构中,开发了许多含多氟烷基结构的高生物活性农药。

发明内容

[0004] 本发明的目的在于提供一种N- (3- (苯并咪唑-2-基) 苯基) 酰胺类化合物及其制备方法和应用,本发明以吡啶并咪唑联吡啶结构为先导,将其电子等排为烷基苯并咪唑联苯结构,在中间苯环间位引入酰胺基团,再进行适当的结构修饰和改造,设计合成出了一系列N- (3- (苯并咪唑-2-基) 苯基) 酰胺类化合物。

[0005] 本发明提供了N- (3- (苯并咪唑-2-基) 苯基) 酰胺类化合物,其结构式如式 (I) 所示:



(I)

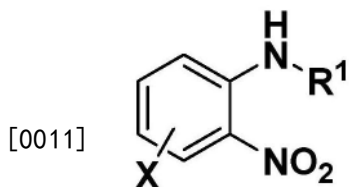
[0007] 式 (I) 中,取代基X为多氟烷基、烷基、卤素、硝基或腈基,取代基R¹取代或不取代,取代时R¹为烷基、苯基或取代烷基,取代基R²取代或不取代,取代时R²为卤素、硝基、腈基、烷氧基、烷硫基、亚砷基或砷基,取代基R³为烷基、烷氧基、取代烷基、取代烷氧基、苯基、取代苯基、杂芳基或取代杂芳基,取代苯基和取代杂芳基上的取代基为烷基、烷氧基、卤素、硝基或腈基。

[0008] 优选地,式 (I) 中,取代基X为三氟甲基或七氟异丙基,取代基R¹取代或不取代,取代时R¹为甲基、乙基或环丙基,取代基R²取代或不取代,取代时R²为2-氯或4-氯,取代基R³为甲基、环己基、乙氧基、正丙氧基、正丁氧基、2-氯乙基、(2,3-二氟苯基) 甲基、苄氧基、苯基、2-甲基苯基、3-甲基苯基、4-甲基苯基、4-叔丁基苯基、3-甲氧基苯基、4-甲氧基苯基、3-氟

苯基、4-氟苯基、2-氯苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、2,6-二氟苯基、2,4-二氯苯基、2-三氟甲基苯基、2-硝基苯基、3-硝基苯基、4-氰基苯基、2-氯-3-硝基苯基、呋喃-2-基、吡啶-3-基、苯氧基、2-氯吡啶-3-基、6-氯吡啶-3-基或3-乙基-1,4-二甲基-1H-吡啶-5-基。

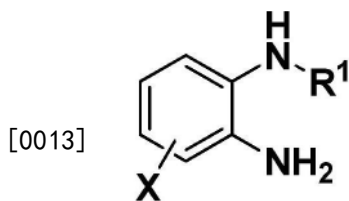
[0009] 进一步地,本发明还提供了N-(3-(苯并咪唑-2-基)苯基)酰胺类化合物的制备方法,包括如下步骤:

[0010] 1) 以二甲基甲酰胺为溶剂,将取代邻硝基氯苯和取代胺 R^1NH_2 室温下反应3-6h,TLC检测反应完全后停止反应,乙酸乙酯萃取,干燥,减压蒸发除去低沸点物得到如式(II)所示的化合物:



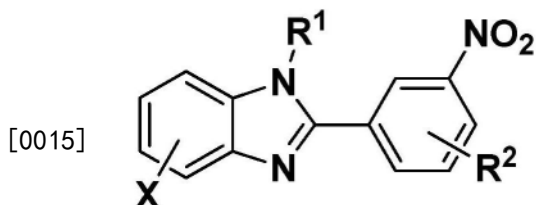
(II)

[0012] 2) 向通过步骤1)得到的如式(II)所示化合物中加入乙醇水溶液、铁粉,滴加饱和氯化铵水溶液,回流反应2~4h,TLC检测反应完全后停止反应,过滤,乙酸乙酯萃取,干燥,减压蒸发除去低沸点物得到如式(III)所示的化合物:



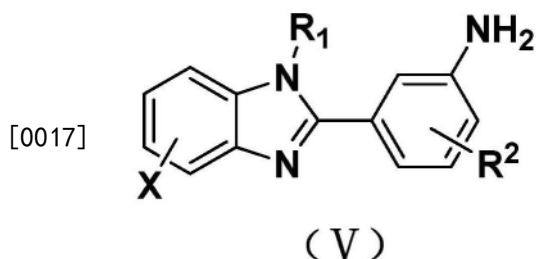
(III)

[0014] 3) 向通过步骤2)得到的如式(III)所示化合物中加入取代间硝基苯甲酸和三氯氧磷,加热回流5~10h,检测反应完全,待反应液冷却至室温后将反应液缓慢倒入冰水中,混合物用乙酸乙酯萃取,干燥,减压蒸发除去低沸点物,经柱层析分离提纯得到如式(IV)所示的化合物:

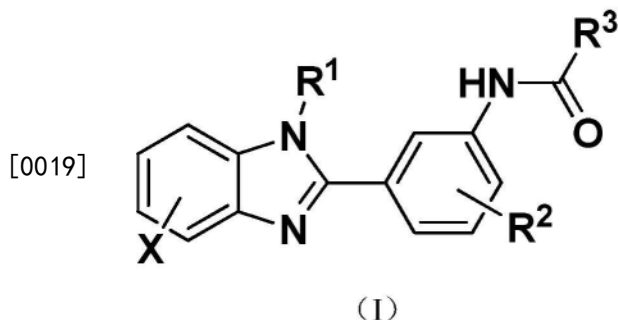


(IV)

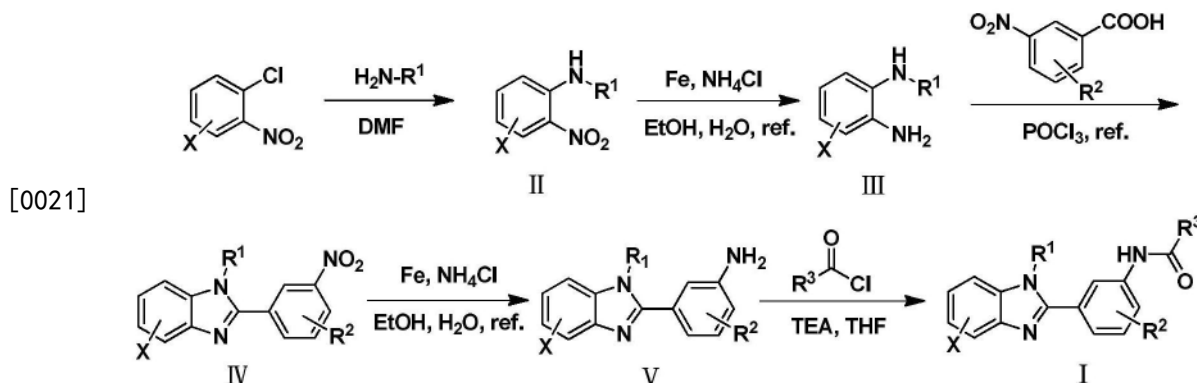
[0016] 4) 向通过步骤3)得到的如式(IV)所示化合物中加入乙醇水溶液、铁粉,滴加饱和氯化铵水溶液,回流反应4~8h,TLC检测反应完全后停止反应,过滤,乙酸乙酯萃取,干燥,减压蒸发除去低沸点物,经柱层析分离提纯得到式(V)所示的化合物:



[0018] 5) 将通过步骤4) 得到的如式 (V) 所示化合物溶解于干燥四氢呋喃中, 加入三乙胺, 在冰盐浴条件下滴加酰氯 R^3COCl , TLC 检测反应完全后停止反应, 过滤, 减压蒸发除去低沸点物, 经柱层析分离提纯得到式 (I) 所示的化合物。



[0020] 其反应过程如下:



[0022] 进一步地, 步骤1) 中, 所述取代邻硝基氯苯和取代胺 R^1NH_2 的物质的量比为1:1~1:2.5; 步骤2) 中, 式 (II) 所示化合物和铁粉的物质的量比为1:2~1:3; 步骤3) 中, 式 (III) 所示化合物、取代间硝基苯甲酸和三氯氧磷的物质的量比为1:1~1.5:3~8; 步骤4) 中, 式 (IV) 所示化合物和铁粉的物质的量比为1:2~1:3; 步骤5) 中, 式 (V) 所示化合物、酰氯 R^3COCl 和三乙胺的物质的量比为1:1~1.5:1.2~2。

[0023] 进一步地, 步骤1) 中溶解取代邻硝基氯苯的二甲基甲酰胺的体积用量以取代邻硝基氯苯的物质的量记为0.5~3mL/mmol, 步骤2) 中溶解式 (II) 所示化合物的乙醇水溶液的体积用量以式 (II) 所示化合物的物质的量记为2~10mL/mmol, 乙醇水溶液中乙醇和水的体积比为2:1~8:1, 溶解式 (V) 所示化合物的四氢呋喃的体积用量以式 (V) 所示化合物的物质的量记为2~6mL/mmol。

[0024] 进一步地, 步骤4) 中滴加饱和氯化铵水溶液的体积用量以式 (IV) 所示化合物的物质的量记为0.2~2mL/mmol。

[0025] 进一步地, 步骤5) 中柱层析分离的洗脱剂均采用体积比3:1的石油醚和乙酸乙酯混合液。

[0026] 进一步地,步骤3)中反应液冷却至室温后,反应液倒入冰水中的速率为倒入冰水中的速率为1~5mL/min。

[0027] 更进一步地,本发明还提供了N-(3-(苯并咪唑-2-基)苯基)酰胺类化合物在制备杀虫剂中的应用。

[0028] 本发明的有益效果在于:

[0029] 本发明制备方法简单、操作方便,所得产物的结构经¹H NMR和MS进行了确认,并对所得的61个目标产物进行了杀虫活性测试,结果表明:在200μg/mL的浓度下大部分化合物具有一定的杀虫活性,其中化合物I-16、I-25、I-31、I-36、I-37、I-44、I-55和I-61对粘虫致死率在85%以上,化合物I-4、I-17、I-25、I-32、I-35和I-40对苜蓿蚜致死率在85%以上,化合物I-7、I-8、I-10、I-20、I-27和I-37对稻飞虱致死率在85%以上。

[0030] 本发明所述化合物为具有杀虫活性的新化合物,为新农药的研发提供了基础。

具体实施方式

[0031] 下面结合具体实施例对本发明作进一步说明,但本发明的保护范围并不限于此。

[0032] 实施例1-4化合物II-1~II-4的制备

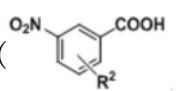
[0033] 室温条件下向250mL三口烧瓶中加入50mmol取代邻硝基氯苯(, 取代基X为

5-CF₃, 5-(CF₃)₂CF或6-(CF₃)₂CF)和50mL DMF,磁力搅拌至充分溶解后滴加50mmol胺(甲胺、环丙胺),室温下反应3h,TLC检测反应完全后停止反应,向反应液中加入乙酸乙酯进行萃取,有机相用饱和食盐水洗三次后无水硫酸镁干燥,减压蒸发除去低沸点物,得到化合物II-1~II-4。

[0034] 实施例5-8化合物III-1~III-4的制备

[0035] 向配有机械搅拌和回流冷凝管的500mL三口烧瓶中加入45mmol化合物II-1~II-4和200mL乙醇水溶液(V_{乙醇}:V_水=5:1),搅拌下加热至80℃时全溶,加入铁粉135mmol,滴加饱和氯化铵水溶液40mL,回流反应,TLC检测反应完全后停止反应,趁热过滤,将滤液浓缩至原体积的1/5后用EA萃取,有机相用饱和食盐水洗三次后无水硫酸镁干燥、减压蒸发除去低沸点物,得到化合物III-1~III-4。

[0036] 实施例9-13化合物IV-1~IV-5的制备

[0037] 向干燥保护的500mL圆底烧瓶中分别加入30mmol化合物III-1~III-4和30mmol化合物取代间硝基苯甲酸(, 苯环上的H被取代基R²不取代或取代,取代时,R²为2-C1

或4-C1),再加入150mmol的三氯氧磷,常温搅拌使原料溶解,加热回流6h,TCL检测反应完全,待反应液冷却至室温后将反应液缓慢倒入500mL冰水中,混合物用乙酸乙酯萃取,有机相用饱和食盐水洗三次后无水硫酸镁干燥,减压蒸发除去低沸点物,用柱色谱(PE:EA=4:1)分离提纯,得到化合物IV-1~IV-5。

[0038] 实施例14-19化合物V-1~V-5的制备

[0039] 向配有机械搅拌和回流冷凝管的1000mL三口烧瓶中分别加入34mmol化合物IV-1~IV-5和204mL乙醇水溶液(V_{乙醇}:V_水=5:1),搅拌下加热至80℃时全溶,加入85mmol铁粉,滴加饱和氯化铵水溶液50mL,继续回流反应7h,TLC检测反应反应完成后停止反应,趁热过滤,

将滤液浓缩至原体积的1/5后用EA萃取,有机相用饱和食盐水洗三次后无水硫酸镁干燥、减压蒸发除去低沸点物,用硅胶柱层析(PE:EA=6:1)分离得到化合物V-1~V-5。

[0040] 实施例20目标产物I-1~I-61的制备

[0041] 在61个50mL单口圆底烧瓶中分别加入5mL干燥的四氢呋喃,在61个加入四氢呋喃的50mL单口圆底烧瓶中分别加入由实施例14-19得到的1mmol化合物V-1~V-5和1.2mmol三乙胺,搅拌均匀,在冰盐浴条件下向加入化合物V-1~V-5和三乙胺的单口圆底烧瓶中缓慢加入1.5mmol取代酰氯R³COCl,常温下搅拌1~3小时,TCL检测反应完全,减压蒸发除去低沸点物得到粗品,之后用硅胶柱层析(PE:EA=3:1)分离得到目标化合物I-1~I-61,具体数据见表1和表2。

[0042] 表1 N-(3-(苯并咪唑-2-基)苯基)酰胺类化合物理化数据

[0043]

目标化合物	取代基团 X	取代基团	取代基团 R ²	取代基团 R ³	外观	收率 %	熔点 °C
I-1	5-CF ₃	甲基	2-Cl	2-氯苯基	白色固体	66.7	260-261
I-2	5-CF ₃	甲基	2-Cl	3-氯苯基	淡黄色固体	56.9	243-245
I-3	5-CF ₃	甲基	2-Cl	3-氟苯基	淡黄色固体	52.6	214-215
I-4	5-CF ₃	甲基	2-Cl	2-三氟甲基苯基	淡灰色固体	55.3	235-237
I-5	5-CF ₃	甲基	2-Cl	4-甲基苯基	淡黄色固体	74.8	231-233
I-6	5-CF ₃	甲基	2-Cl	4-甲氧基苯基	白色固体	62.3	227-229
I-7	5-CF ₃	甲基	2-Cl	4-叔丁基苯基	淡黄色固体	66.8	201-203
I-8	5-CF ₃	甲基	2-Cl	2,6-二氟苯基	白色固体	44.7	221-223

[0044]

I-9	5-CF ₃	甲基	2-Cl	2,4-二氯苯基	淡黄色固体	61.5	245-247
I-10	5-CF ₃	甲基	2-Cl	2-氯乙基	淡黄色固体	59.7	216-218
I-11	5-CF ₃	甲基	2-Cl	环己基	白色固体	44.7	193-195
I-12	5-CF ₃	甲基	4-Cl	苯基	淡黄色固体	51.4	111-113
I-13	5-CF ₃	甲基	4-Cl	2-氯苯基	白色固体	57.0	230-231
I-14	5-CF ₃	甲基	4-Cl	3-氯苯基	淡黄色固体	61.7	115-117
I-15	5-CF ₃	甲基	4-Cl	4-氯苯基	白色固体	67.4	210-212
I-16	5-CF ₃	甲基	4-Cl	4-氟-苯基	淡黄色固体	51.1	121-122
I-17	5-CF ₃	甲基	4-Cl	2-三氟甲基苯基	淡黄色固体	53.1	128-130
I-18	5-CF ₃	甲基	4-Cl	2-硝基苯基	淡黄色固体	49.3	251-252
I-19	5-CF ₃	甲基	4-Cl	3-硝基苯基	淡黄色固体	64.9	148-150
I-20	5-CF ₃	甲基	4-Cl	4-氰基苯基	淡黄色固体	45.1	156-157
I-21	5-CF ₃	甲基	4-Cl	2-甲基苯基	淡黄色固体	69.3	122-124
I-22	5-CF ₃	甲基	4-Cl	3-甲基苯基	淡黄色固体	49.6	115-117
I-23	5-CF ₃	甲基	4-Cl	4-叔丁基苯基	淡黄色固体	67.5	194-196
I-24	5-CF ₃	甲基	4-Cl	3-甲氧基苯基	淡黄色固体	59.1	127-129
I-25	5-CF ₃	甲基	4-Cl	4-甲氧基苯基	白色固体	63.1	111-113
I-26	5-CF ₃	甲基	4-Cl	2,4-二氯苯基	淡黄色固体	65.3	133-135
I-27	5-CF ₃	甲基	4-Cl	2-氯-3-硝基苯基	淡黄色固体	53.6	125-126
I-28	5-CF ₃	甲基	4-Cl	呋喃-2-基	淡黄色固体	58.7	112-113
I-29	5-CF ₃	甲基	4-Cl	吡啶-3-基	淡黄色固体	52.1	234-236
I-30	5-CF ₃	甲基	4-Cl	6-氯吡啶-3-yl	淡黄色固体	67.3	286-287
I-31	5-CF ₃	甲基	4-Cl	3-乙基-1,4-二甲 基-1 <i>H</i> -吡唑-5-基	淡黄色固体	72.5	189-190

[0045]

I -32	5-CF ₃	甲基	4-Cl	2,3-二氟苄基	淡黄色固体	50.2	151-153
I -33	5-CF ₃	甲基	4-Cl	甲基	淡黄色固体	48.8	118-120
I -34	5-CF ₃	甲基	4-Cl	乙氧基	淡黄色固体	61.5	103-106
I -35	5-CF ₃	甲基	4-Cl	正丙氧基	白色固体	56.9	99-101
I -36	5-CF ₃	甲基	4-Cl	正丁氧基	白色固体	70.7	93-95
I -37	5-CF ₃	甲基	4-Cl	苄氧基	白色固体	50.7	221-222
I -38	5-CF ₃	环丙	2-Cl	2-氯苄基	淡黄色固体	45.9	210-212
I -39	5-CF ₃	环丙	2-Cl	3-氯苄基	淡黄色固体	51.9	220-222
I -40	5-CF ₃	环丙	2-Cl	3-氟苄基	淡灰色固体	57.1	203-205
I -41	5-CF ₃	环丙	2-Cl	2-三氟甲基苄基	淡灰色固体	44.6	246-248
I -42	5-CF ₃	环丙	2-Cl	3-硝基苄基	淡黄色固体	48.6	116-117
I -43	5-CF ₃	环丙	2-Cl	3-甲基苄基	白色固体	56.3	121-123
I -44	5-CF ₃	环丙	2-Cl	4-甲氧基苄基	淡灰色固体	46.5	158-161
I -45	5-CF ₃	环丙	2-Cl	4-叔丁基苄基	淡黄色固体	70.3	100-102
I -46	5-CF ₃	环丙	2-Cl	2,6-二氟苄基	淡黄色固体	77.5	227-230
I -47	5-CF ₃	环丙	2-Cl	2,4-氯苄基	白色固体	62.0	225-226
I -48	5-CF ₃	环丙	2-Cl	6-氯吡啶-3-基	白色固体	47.9	166-168
I -49	5-CF ₃	环丙	2-Cl	环己基	淡黄色固体	65.8	158-160
I -50	5-(CF ₃) ₂ CF	甲基	不取代	2-氯苄基	白色固体	69.4	178-180
I -51	5-(CF ₃) ₂ CF	甲基	不取代	3-氯苄基	白色固体	72.7	224-225
I -52	5-(CF ₃) ₂ CF	甲基	不取代	4-氯苄基	白色固体	75.8	145-147
I -53	5-(CF ₃) ₂ CF	甲基	不取代	2-三氟甲基苄基	白色固体	65.3	132-134
I -54	5-(CF ₃) ₂ CF	甲基	不取代	4-氰基苄基	白色固体	64.1	137-138
I -55	5-(CF ₃) ₂ CF	甲基	不取代	苄氧基	淡黄色固体	66.1	173-175

[0046]

I -56	6-(CF ₃) ₂ CF	甲基	不取代	2-氯苯基	白色固体	69.5	118-120
I -57	6-(CF ₃) ₂ CF	甲基	不取代	3-氯苯基	白色固体	63.2	114-116
I -58	6-(CF ₃) ₂ CF	甲基	不取代	4-氯苯基	白色固体	60.0	287-288
I -59	6-(CF ₃) ₂ CF	甲基	不取代	2-三氟甲基苯基	白色固体	71.2	126-127
I -60	6-(CF ₃) ₂ CF	甲基	不取代	4-氰基苯基	白色固体	58.4	273-274
I -61	6-(CF ₃) ₂ CF	甲基	不取代	苯氧基	淡黄色固体	71.9	201-203

[0047] 表2 N-(3-(苯并咪唑-2-基)苯基)酰胺类化合物¹H NMR和MS数据

[0048]

实施例	¹ H NMR 和 MS 表征数据
I -1	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ : 3.72 (s, 3H, CH ₃), 7.36 (dd, $J = 7.6, 1.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.43 (td, $J = 7.4, 1.5$ Hz, 1H), 7.47 (td, $J = 7.6, 1.8$ Hz, 1H), 7.49 – 7.51 (m, 3H), 7.63 (dd, $J = 8.5, 1.3$ Hz, 1H, Ph-H), 7.86 (dd, $J = 7.6, 1.4$ Hz, 1H, Ph-H), 8.11 (s, 1H, Ph-H), 8.67 (s, 1H, CONH), 8.79 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for C ₂₂ H ₁₅ Cl ₂ F ₃ N ₃ O ([M + H] ⁺) 464, found 464.
I -2	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ : 3.73 (s, 3H, CH ₃), 7.37 (dd, $J = 7.6, 1.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.48 (t, $J = 7.9$ Hz, 1H, Ph-H), 7.51 – 7.56 (m, 2H, Ph-H), 7.58 – 7.59 (m, 1H, Ph-H), 7.64 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.80 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H, Ph-H), 7.94 (t, $J = 1.8$ Hz, 1H, Ph-H), 8.14 (s, 1H, Ph-H), 8.51 (s, 1H, CONH), 8.72 (dd, $J = 8.4, 1.4$ Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for C ₂₂ H ₁₃ Cl ₂ F ₃ N ₃ O ([M - H] ⁻) 462, found 462.
I -3	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ : 3.73 (s, 3H, CH ₃), 7.30 – 7.33 (m, 1H, Ph-H), 7.38 (dd, $J = 7.6, 1.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.51 – 7.56 (m, 3H, Ph-H), 7.64 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.68 (dd, $J = 9.0, 2.1$ Hz, 1H, Ph-H), 7.70 (d, $J = 7.9$ Hz, 1H, Ph-H), 8.15 (s, 1H, Ph-H), 8.55 (s, 1H, CONH), 8.74 (dd, $J = 8.4, 1.4$ Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for C ₂₂ H ₁₅ ClF ₄ N ₃ O ([M + H] ⁺) 448, found 448.
I -4	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ : 3.71 (s, 3H, CH ₃), 7.36 (d, $J = 7.6$ Hz, 1H,

[0049]

	Ph-H), 7.49 – 7.53 (m, 2H, Ph-H), 7.59 – 7.61 (m, 1H, Ph-H), 7.65 (t, $J = 7.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.69 – 7.74 (m, 2H, Ph-H), 7.80 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H, Ph-H), 7.96 (s, 1H, Ph-H), 8.45 (s, 1H, CONH), 8.62 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for $C_{23}H_{15}ClF_6N_3O$ ($[M + H]^+$) 498, found 498.
I -5	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 2.45 (s, 3H, Ph- CH_3), 3.72 (s, 3H, N- CH_3), 7.34 (d, $J = 8.3$ Hz, 3H, Ph-H), 7.51 – 7.54 (m, 2H, Ph-H), 7.63 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.84 (d, $J = 8.2$ Hz, 2H, Ph-H), 8.14 (s, 1H, Ph-H), 8.55 (s, 1H, CONH), 8.78 (dd, $J = 8.4, 1.3$ Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for $C_{23}H_{18}ClF_3N_3O$ ($[M + H]^+$) 444, found 444.
I -6	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.72 (s, 3H, O- CH_3), 3.89 (s, 3H, N- CH_3), 7.01 – 7.04 (m, 2H, Ph-H), 7.32 (dd, $J = 7.6, 1.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.51 – 7.53 (m, 2H, Ph-H), 7.63 (dd, $J = 8.5, 1.3$ Hz, 1H, Ph-H), 7.90 – 7.93 (m, 2H, Ph-H), 8.13 (s, 1H, Ph-H), 8.49 (s, 1H, CONH), 8.77 (dd, $J = 8.4, 1.5$ Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for $C_{23}H_{18}ClF_3N_3O_2$ ($[M + H]^+$) 460, found 460.
I -7	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 1.36 (s, 9H, $C(CH_3)_3$), 3.72 (s, 3H, N- CH_3), 7.34 (dd, $J = 7.6, 1.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.50 – 7.56 (m, 4H, Ph-H), 7.63 (dd, $J = 8.6, 1.7$ Hz, 1H, Ph-H), 7.90– 7.92 (m, 2H, Ph-H), 8.13 (s, 1H, Ph-H), 8.68 (s, 1H, CONH), 8.73 (dd, $J = 8.4, 1.5$ Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for $C_{26}H_{24}ClF_3N_3O$ ($[M + H]^+$) 486, found 486.
I -8	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.72 (s, 3H, N- CH_3), 7.05 (t, $J = 8.3$ Hz, 2H, Ph-H), 7.37 (dd, $J = 7.6, 1.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.46 – 7.54 (m, 3H, Ph-H), 7.62 (dd, $J = 8.4, 1.3$ Hz, 1H, Ph-H), 8.07 (s, 1H, Ph-H), 8.50 (s, 1H, CONH), 8.72 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for $C_{22}H_{14}ClF_5N_3O$ ($[M + H]^+$) 466, found 466.
I -9	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.72 (s, 3H, N- CH_3), 7.37 (dd, $J = 7.6, 1.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.42 (dd, $J = 8.4, 2.0$ Hz, 1H, Ph-H), 7.50 – 7.55 (m, 3H, Ph-H), 7.63 (dd, $J = 8.4, 1.8$ Hz, 1H, Ph-H), 7.83 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H, Ph-H), 8.10 (s, 1H, Ph-H), 8.71 (s, 1H, CONH), 8.75 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H, Ph-H);

[0050]

	ESI-MS calcd for $C_{22}H_{14}Cl_3F_3N_3O$ ($[M + H]^+$) 498, found 498.
I -10	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.71 (s, 3H, N- CH_3), 4.28 (s, 2H, Cl- CH_2), 7.37 (dd, $J = 7.6, 1.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.51 (dd, $J = 15.6, 8.0$ Hz, 2H, Ph-H), 7.49 – 7.53 (m, 1H, Ph-H), 8.13 (s, 1H, Ph-H), 8.61 (dd, $J = 8.4, 1.4$ Hz, 1H, Ph-H), 9.06 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{17}H_{13}Cl_2F_3N_3O$ ($[M + H]^+$) 402, found 402.
I -11	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 1.32 – 1.40 (m, 2H, CH_2), 1.54 – 1.61 (m, 4H, CH_2), 1.85 – 1.89 (m, 2H, CH_2), 2.03 – 2.06 (m, 2H, CH_2), 2.33 – 2.39 (m, 1H, CH), 3.70 (s, 3H, N- CH_3), 7.28 (dd, $J = 7.6, 1.6$ Hz, 1H), 7.46 (t, $J = 8.0$ Hz, 1H), 7.51 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H), 7.62 (dd, $J = 8.5, 1.7$ Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.62 (dd, $J = 8.5, 1.6$ Hz, 1H); ESI-MS calcd for $C_{22}H_{22}ClF_3N_3O$ ($[M + H]^+$) 436, found 436.
I -12	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ 3.74 (s, 3H, N- CH_3), 7.34 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H, Ph-H), 7.45 – 7.51 (m, 3H, Ph-H), 7.60 (dd, $J = 8.1, 2.4$ Hz, 1H, Ph-H), 7.78 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.86 – 7.89 (m, 3H, Ph-H), 8.01 (dd, $J = 8.8, 2.6$ Hz, 1H, Ph-H), 9.55 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{22}H_{16}ClF_3N_3O$ ($[M + H]^+$) 430, found 430.
I -13	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.73 (s, 3H, N- CH_3), 7.16 (t, $J = 7.4$ Hz, 1H, Ph-H), 7.21 (td, $J = 7.7, 1.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.30 (d, $J = 7.9$ Hz, 1H, Ph-H), 7.44 – 7.47 (m, 2H, Ph-H), 7.54 – 7.57 (m, 2H, Ph-H), 7.65 (s, 1H, Ph-H), 7.81 (d, $J = 2.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.95 (dd, $J = 8.8, 2.5$ Hz, 1H, Ph-H), 10.25 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{22}H_{15}Cl_2F_3N_3O$ ($[M + H]^+$) 464, found 464.
I -14	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.73 (s, 3H, N- CH_3), 7.22 (t, $J = 7.9$ Hz, 1H, Ph-H), 7.36 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H, Ph-H), 7.45 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H, Ph-H), 7.51 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.60 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.74 (d, $J = 2.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.76 (d, $J = 7.9$ Hz, 1H, Ph-H), 7.79 (s, 1H, Ph-H), 7.83 (s, 1H, Ph-H), 8.03 (dd, $J = 8.8, 2.5$ Hz, 1H, Ph-H), 10.22 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{22}H_{15}Cl_2F_3N_3O$ ($[M + H]^+$) 464, found 464.

[0051]

I -15	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: δ 3.73 (s, 3H, N-CH ₃), 7.28 (d, 2H, <i>J</i> = 8.4 Hz, Ph-H), 7.48-7.52 (m, 2H, Ph-H), 7.61 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.74 (d, <i>J</i> = 2.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.80 – 7.83 (m, 3H, Ph-H), 8.04 (dd, <i>J</i> = 8.8, 2.5 Hz, 1H, Ph-H), 9.85 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for C ₂₂ H ₁₅ Cl ₂ F ₃ N ₃ O ([M + H] ⁺) 464, found 464.
I -16	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 3.74 (s, 3H, N-CH ₃), 6.97 (t, <i>J</i> = 8.6 Hz, 2H, Ph-H), 7.47 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H, Ph-H), 7.51 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.61 (dd, <i>J</i> = 8.5, 1.1 Hz, 1H, Ph-H), 7.75 (d, <i>J</i> = 2.6 Hz, 1H, Ph-H), 7.83 (s, 1H, Ph-H), 7.87 – 7.910 (m, 2H, Ph-H), 8.04 (dd, <i>J</i> = 8.8, 2.6 Hz, 1H, Ph-H), 9.90 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for C ₂₂ H ₁₃ ClF ₄ N ₃ O ([M - H] ⁻) 446, found 446.
I -17	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 3.73 (s, 3H, N-CH ₃), 7.33 – 7.35 (m, 2H, Ph-H), 7.43 – 7.48 (m, 3H, Ph-H), 7.50 – 7.53 (m, 2H, Ph-H), 7.63 – 7.65 (m, 1H, Ph-H), 7.75 (d, <i>J</i> = 2.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.99 (dd, <i>J</i> = 8.8, 2.5 Hz, 1H, Ph-H), 10.59 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for C ₂₃ H ₁₅ ClF ₆ N ₃ O ([M + H] ⁺) 498, found 498.
I -18	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 3.72 (s, 3H, N-CH ₃), 7.35 (s, 1H, Ph-H), 7.37 (td, <i>J</i> = 7.9, 1.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.42 – 7.46 (m, 3H, Ph-H), 7.52 (dd, <i>J</i> = 8.6, 1.6 Hz, 1H, Ph-H), 7.57 (dd, <i>J</i> = 7.5, 1.1 Hz, 1H, Ph-H), 7.74 (d, <i>J</i> = 2.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.90 (dd, <i>J</i> = 8.8, 2.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.94 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H, Ph-H), 11.25 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for C ₂₂ H ₁₅ ClF ₃ N ₄ O ₃ ([M + H] ⁺) 475, found 475.
I -19	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 3.74 (s, 3H, N-CH ₃), 7.46-7.52 (m, 3H, Ph-H), 7.58 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz, 1H, Ph-H), 7.63 (s, 1H, Ph-H), 7.74 (d, <i>J</i> = 2.6 Hz, 1H, Ph-H), 8.08 (dd, <i>J</i> = 8.8, 2.5 Hz, 1H, Ph-H), 8.20 – 8.24 (m, 2H, Ph-H), 8.63 (t, <i>J</i> = 1.8 Hz, 1H, Ph-H), 10.83 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for C ₂₂ H ₁₅ ClF ₃ N ₄ O ₃ ([M + H] ⁺) 475, found 475.
I -20	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 3.73 (s, 3H, N-CH ₃), 7.47 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 2H, Ph-H), 7.51 (d, <i>J</i> = 8.9 Hz, 2H, Ph-H), 7.59-7.61 (m, 2H, Ph-H), 7.74

[0052]

	(d, $J = 2.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.91 (d, $J = 8.3$ Hz, 2H, Ph-H), 8.20 (dd, $J = 8.9$, 2.5 Hz, 1H, Ph-H), 11.03 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{23}H_{15}ClF_3N_4O$ ($[M + H]^+$) 455, found 455.
I -21	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 2.49 (s, 3H, Ph- CH_3), 3.74 (s, 3H, N- CH_3), 7.08 (t, $J = 7.4$ Hz, 1H, Ph-H), 7.18 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.23 (t, $J = 7.4$ Hz, 1H, Ph-H), 7.42 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.46 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.52 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H, Ph-H), 7.56 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.74 (s, 1H, Ph-H), 7.78 (d, $J = 2.2$ Hz, 1H, Ph-H), 7.99 ((dd, $J = 9.0$, 2.5 Hz, 1H, Ph-H), 9.22 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{23}H_{18}ClF_3N_3O$ ($[M + H]^+$) 444, found 444.
I -22	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 2.41 (s, 3H, Ph- CH_3), 3.74 (s, 3H, N- CH_3), 7.24 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H, Ph-H), 7.35 (t, $J = 7.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.48 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H, Ph-H), 7.51 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.66 – 7.67 (m, 2H, Ph-H), 7.78 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.86 (s, 1H, Ph-H), 7.91 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 8.04 (dd, $J = 8.8$, 2.6 Hz, 1H, Ph-H), 9.56 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{23}H_{18}ClF_3N_3O$ ($[M + H]^+$) 444, found 444.
I -23	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 1.26 (s, 9H, $C(CH_3)_3$), 3.74 (s, 3H, N- CH_3), 7.34 (d, $J = 8.3$ Hz, 2H, Ph-H), 7.43 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H, Ph-H), 7.51 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.60 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.77 (d, $J = 2.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.82 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H, Ph-H), 7.92 – 7.94 (m, $J = 8.5$, 2.6 Hz, 2H, Ph-H), 9.55 (s, 1H, CONH), MS calcd for $C_{26}H_{23}ClF_3N_3O$ ($[M + H]^+$) 486, found 486.
I -24	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.75 (s, 3H, N- CH_3), 3.81 (s, 3H, O- CH_3), 7.04 (dd, $J = 8.2$, 2.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.29 (t, $J = 7.9$ Hz, 1H, Ph-H), 7.40 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H, Ph-H), 7.43 (s, 1H, Ph-H), 7.50 – 7.52 (m, 2H, Ph-H), 7.61 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H, Ph-H), 7.77 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.96 (dd, $J = 8.8$, 2.6 Hz, 1H, Ph-H), 7.99 (s, 1H, Ph-H), 8.93 (s, 1H, CONH), MS calcd for $C_{23}H_{18}ClF_3N_3O_2$ ($[M + H]^+$) 460, found 460.
I -25	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.75 (s, 3H, N- CH_3), 3.82 (s, 3H, O- CH_3),

[0053]

	6.87 – 6.90 (m, 2H, Ph-H), 7.49 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H, Ph-H), 7.51 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.61 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.76 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.85 (d, $J = 8.8$ Hz, 2H, Ph-H), 7.95 (dd, $J = 8.8, 2.6$ Hz, 1H, Ph-H), 8.00 (s, 1H, Ph-H), 8.88 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{23}H_{18}ClF_3N_3O_2$ ($[M + H]^+$) 460, found 460.
I -26	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.73 (s, 3H, N- CH_3), 7.01 (dd, $J = 8.3, 1.9$ Hz, 1H, Ph-H), 7.25 (d, $J = 1.9$ Hz, 1H, Ph-H), 7.39 (d, $J = 8.3$ Hz, 1H, Ph-H), 7.46 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.49 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H, Ph-H), 7.56 (dd, $J = 8.5, 1.9$ Hz, 1H, Ph-H), 7.60 (s, 1H, Ph-H), 7.75 (d, $J = 2.5$ Hz, 1H, Ph-H), 8.12 (dd, $J = 8.8, 2.5$ Hz, 1H, Ph-H), 10.94 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{22}H_{14}Cl_3F_3N_3O$ ($[M + H]^+$) 498, found 498.
I -27	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.75 (s, 3H, N- CH_3), 7.30 (t, $J = 7.9$ Hz, 1H, Ph-H), 7.48 (d, $J = 8.3$ Hz, 1H, Ph-H), 7.53 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H, Ph-H), 7.57 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.61-7.64 (m, 2H, Ph-H), 7.69 (dd, $J = 7.7, 1.4$ Hz, 1H, Ph-H), 7.80 (d, $J = 2.5$ Hz, 1H, Ph-H), 8.16 (dd, $J = 8.8, 2.5$ Hz, 1H, Ph-H), 10.74 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{22}H_{14}Cl_2F_3N_4O_3$ ($[M + H]^+$) 509, found 509.
I -28	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.75 (s, 3H, N- CH_3), 6.53 (dd, $J = 3.5, 1.7$ Hz, 1H, furan-H), 7.23 (d, $J = 3.5$ Hz, 1H, furan-H), 7.40 (s, 1H, furan-H), 7.49 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H, Ph-H), 7.53 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.63 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.82 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.94 (dd, $J = 8.8, 2.6$ Hz, 1H, Ph-H), 8.12 (s, 1H, Ph-H), 8.82 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{20}H_{14}ClF_3N_3O_2$ ($[M + H]^+$) 420, found 420.
I -29	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.73 (s, 3H, N- CH_3), 7.23 (dd, $J = 7.9, 4.8$ Hz, 1H, pyridine-H), 7.50 (t, $J = 8.3$ Hz, 2H, Ph-H), 7.59 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.73 (d, $J = 2.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.76 (s, 1H, Ph-H), 8.06 (dd, $J = 8.8, 2.5$ Hz, 1H, Ph-H), 8.19 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H, pyridine-H), 8.62 (d, $J = 4.8$ Hz, 1H, pyridine-H), 9.09 (d, $J = 1.9$ Hz, 1H, pyridine-H), 10.45 (s, 1H, NH); ESI-MS calcd for $C_{21}H_{15}ClF_3N_4O$ ($[M + H]^+$) 431, found 431.

[0054]

I -30	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 3.74 (s, 2H, CH ₃), 7.30 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 1H, pyridine-H), 7.49-7.53 (m, 2H, Ph-H), 7.63 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.71 (d, <i>J</i> = 2.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.85 (s, 1H, Ph-H), 8.00 (dd, <i>J</i> = 8.9, 2.4 Hz, 1H, Ph-H), 8.16 (dd, <i>J</i> = 8.3, 2.4 Hz, 1H, pyridine-H), 8.88 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz, 1H, pyridine-H), 9.98 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for C ₂₁ H ₁₄ Cl ₂ F ₃ N ₄ O ([M + H] ⁺) 465, found 465.
I -31	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 1.26 (t, <i>J</i> = 7.6 Hz, 3H, CH ₂ CH ₃), 2.67 (q, <i>J</i> = 7.6 Hz, 2H, CH ₂ CH ₃), 3.77 (s, 3H, N-CH ₃), 4.16 (s, 3H, pyrazole-CH ₃), 7.52 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.57 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H, Ph-H), 7.60–7.65 (m, 1H, Ph-H), 7.83 (d, <i>J</i> = 2.6 Hz, 1H, Ph-H), 7.91 (dd, <i>J</i> = 8.8, 2.6 Hz, 1H, Ph-H), 8.11 (s, 1H, Ph-H), 8.62 (s, 2H, CONH); ESI-MS calcd for C ₂₃ H ₂₂ ClF ₃ N ₅ O ([M + H] ⁺) 476, found 476.
I -32	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 3.73 (s, 2H, CH ₂), 3.74 (s, 3H, N-CH ₃), 7.06-7.13 (m, 3H, Ph-H), 7.47 (d, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H, Ph-H), 7.52 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.56 (s, 1H, Ph-H), 7.62 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 8.00 (d, <i>J</i> = 9.1 Hz, 1H, Ph-H), 8.05 (s, 1H, Ph-H), 8.94 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for C ₂₃ H ₁₆ ClF ₅ N ₃ O ([M + H] ⁺) 480, found 480.
I -33	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 2.07 (s, 3H, CH ₃), 3.74 (s, 3H, N-CH ₃), 7.41 (d, <i>J</i> = 8.9 Hz, 1H, Ph-H), 7.51 (d, <i>J</i> = 2.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.54 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.63 (dd, <i>J</i> = 8.5, 1.0 Hz, 1H, Ph-H), 8.05 (s, 1H, Ph-H), 8.10 (dd, <i>J</i> = 8.9, 2.5 Hz, 1H, Ph-H), 10.08 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for C ₁₉ H ₂₀ ClF ₃ N ₃ O ([M + H] ⁺) 368, found 368.
I -34	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 1.28 (t, <i>J</i> = 7.1 Hz, 3H, CH ₂ CH ₃), 3.73 (s, 3H, N-CH ₃), 4.22 (q, <i>J</i> = 7.1 Hz, 2H, CH ₂ CH ₃), 7.39 (br s, 1H, NH), 7.46 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H, Ph-H), 7.50 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.56 (d, <i>J</i> = 2.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.61 (dd, <i>J</i> = 8.4, 1.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.67 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H, Ph-H), 8.10 (s, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for C ₁₈ H ₁₆ ClF ₃ N ₃ O ₂ ([M + H] ⁺) 398, found 398.
I -35	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 0.92 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H, CH ₂ CH ₂ CH ₃),

[0055]

	1.63-1.68 (m, 2H, CH ₂ CH ₂ CH ₃), 3.73 (s, 3H, N-CH ₃), 4.11 (t, <i>J</i> = 6.7 Hz, 2H, O-CH ₂), 7.45 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H, Ph-H), 7.50 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.56 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz, 1H, Ph-H), 7.61 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.68 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H, Ph-H), 8.10 (s, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for C ₁₉ H ₁₈ ClF ₃ N ₃ O ₂ ([M + H] ⁺) 412, found 412.
I -36	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: δ 0.88 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H, (CH ₂) ₃ CH ₃), 1.29-1.36 (m, 2H, (CH ₂) ₂ CH ₂ CH ₃), 1.57-1.62 (m, 2H, CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃), 3.73 (s, 3H, N-CH ₃), 4.14 (t, <i>J</i> = 6.6 Hz, 2H, O-CH ₂), 7.44 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H, Ph-H), 7.50 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.55 (d, <i>J</i> = 2.4 Hz, 1H, Ph-H), 7.63 – 7.59 (m, 1H, Ph-H), 7.71 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H, Ph-H), 7.89 (br s, 1H, NH) 8.10 (s, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for C ₂₀ H ₂₀ ClF ₃ N ₃ O ₂ ([M + H] ⁺) 426, found 426.
I -37	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 3.72 (s, 3H, N-CH ₃), 5.19 (s, 2H, O-CH ₂), 7.34 – 7.36 (m, 5H, Ph-H), 7.46 (d, <i>J</i> = 8.8 Hz, 1H, Ph-H), 7.50 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.58 (d, <i>J</i> = 2.3 Hz, 1H, Ph-H), 7.61 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 1H, Ph-H), 7.65 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H, Ph-H), 8.09 (s, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for C ₂₃ H ₁₈ ClF ₃ N ₃ O ₂ ([M + H] ⁺) 460, found 460.
I -38	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 0.74 – 0.77 (m, 2H, CH ₂), 0.99 – 1.02 (m, 2H, CH ₂), 3.44 – 3.48 (m, 1H, CH), 7.32 – 7.35 (m, 2H, Ph-H), 7.39 (dd, <i>J</i> = 7.6, 1.4 Hz, 1H, Ph-H), 7.44 – 7.48 (m, 1H, Ph-H), 7.62 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.73 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.86 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H, Ph-H), 7.95 (dd, <i>J</i> = 7.7, 1.6 Hz, 1H, Ph-H), 8.11 (s, 1H, Ph-H), 8.75 (s, 1H, CONH), 8.78 (d, <i>J</i> = 8.2 Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for C ₂₄ H ₁₇ Cl ₂ F ₃ N ₃ O ([M + H] ⁺) 490, found 490.
I -39	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 0.75 – 0.77 (m, 2H, CH ₂), 0.98 – 1.01 (m, 2H, CH ₂), 3.44 – 3.47 (m, 1H, CH), 7.37 (dd, <i>J</i> = 7.6, 1.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.46 – 7.59 (m, 4H, Ph-H), 7.63 (dd, <i>J</i> = 8.5, 1.6 Hz, 1H, Ph-H), 7.74 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.81 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H, Ph-H), 8.12 (s, 1H, Ph-H), 8.55 (s, 1H, CONH), 8.72 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for

[0056]

	$C_{24}H_{17}Cl_2F_3N_3O$ ($[M + H]^+$) 490, found 490.
I -40	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 0.75 – 0.77 (m, 2H, CH_2), 0.98 – 1.01 (m, 2H, CH_2), 3.43 – 3.47 (m, 1H, CH), 7.29 – 7.33 (m, 1H, Ph-H), 7.37 (dd, $J = 7.6, 1.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.49 – 7.54 (m, 2H, Ph-H), 7.62 (dd, $J = 8.5, 1.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.68 (dt, $J = 9.1, 2.1$ Hz, 1H, Ph-H), 7.71 (dt, $J = 7.8, 1.3$ Hz, 1H, Ph-H), 7.73 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 8.12 (s, 1H, Ph-H), 8.57 (s, 1H, CONH), 8.75 (dd, $J = 8.4, 1.5$ Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for $C_{24}H_{17}ClF_4N_3O$ ($[M + H]^+$) 474, found 474.
I -41	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 0.74 – 0.76 (m, 2H, CH_2), 0.98 – 1.01 (m, 2H, CH_2), 3.41 – 3.45 (m, 1H, CH), 7.37 (dd, $J = 7.6, 1.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.51 (t, $J = 8.0$ Hz, 1H, Ph-H), 7.58 – 7.62 (m, 1H, Ph-H), 7.65 (t, $J = 7.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.69 – 7.74 (m, 3H, Ph-H), 7.80 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H, Ph-H), 8.01 (s, 1H, Ph-H), 8.30 (s, 1H, CONH), 8.66 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H, Ph-H). ESI-MS calcd for $C_{25}H_{17}ClF_6N_3O$ ($[M + H]^+$) 524, found 524.
I -42	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 0.76 – 0.78 (m, 2H, CH_2), 0.99 – 1.02 (m, 2H, CH_2), 3.45 – 3.49 (m, 1H, CH), 7.41 (dd, $J = 7.6, 1.4$ Hz, 1H, Ph-H), 7.55 (t, $J = 8.0$ Hz, 1H, Ph-H), 7.63 (dd, $J = 8.4, 1.7$ Hz, 1H, Ph-H), 7.73 – 7.78 (m, 2H, Ph-H), 8.11 (s, 1H, Ph-H), 8.29 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H, Ph-H), 8.46 – 8.48 (m, 1H, Ph-H), 8.61 (s, 1H, CONH), 8.72 (dd, $J = 8.3, 1.2$ Hz, 1H, Ph-H), 8.81 (t, $J = 1.9$ Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for $C_{24}H_{17}ClF_3N_4O_3$ ($[M + H]^+$) 501, found 501.
I -43	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 0.75 – 0.77 (m, 2H, CH_2), 0.97 – 1.00 (m, 2H, CH_2), 2.46 (s, 3H, Ph- CH_3), 3.43 – 3.46 (m, 1H, CH), 7.33 (dd, $J = 7.6, 1.4$ Hz, 1H, Ph-H), 7.41 – 7.42 (m, 2H, Ph-H), 7.51 (t, $J = 8.0$ Hz, 1H, Ph-H), 7.62 (dd, $J = 8.5, 1.1$ Hz, 1H, Ph-H), 7.71 – 7.73 (m, 2H, Ph-H), 7.77 (s, 1H, Ph-H), 8.11 (s, 1H, Ph-H), 8.56 (s, 1H, CONH), 8.79 (dd, $J = 8.3, 1.3$ Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for $C_{25}H_{20}ClF_3N_3O$ ($[M + H]^+$) 470, found 470.
I -44	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 0.74 – 0.77 (m, 2H, CH_2), 0.97 – 1.00 (m,

[0057]

	2H, CH ₂), 3.42 – 3.46 (m, 1H, CH), 3.89 (s, 3H, O-CH ₃), 7.02 (d, <i>J</i> = 8.9 Hz, 2H, Ph-H), 7.32 (dd, <i>J</i> = 7.6, 1.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.50 (t, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H, Ph-H), 7.62 (dd, <i>J</i> = 8.5, 1.6 Hz, 1H, Ph-H), 7.73 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.92 (d, <i>J</i> = 8.9 Hz, 2H, Ph-H), 8.11 (s, 1H, Ph-H), 8.53 (s, 1H, CONH), 8.78 (dd, <i>J</i> = 8.3, 1.6 Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for C ₂₅ H ₂₀ ClF ₃ N ₃ O ₂ ([M + H] ⁺) 486, found 486.
I -45	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 0.72 – 0.79 (m, 2H, CH ₂), 0.97 – 1.00 (m, 2H, CH ₂), 1.37 (s, 9H, C(CH ₃) ₃), 3.43 – 3.47 (m, 1H, CH), 7.33 (dd, <i>J</i> = 7.6, 1.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.51 (t, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H, Ph-H), 7.56 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 2H, Ph-H), 7.62 (dd, <i>J</i> = 8.5, 1.7 Hz, 1H, Ph-H), 7.73 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.89 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 2H, Ph-H), 8.11 (s, 1H), 8.60 (s, 1H, CONH), 8.80 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for C ₂₈ H ₂₆ ClF ₃ N ₃ O ([M + H] ⁺) 512, found 512.
I -46	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 0.74 – 0.76 (m, 2H, CH ₂), 0.93 – 1.01 (m, 2H, CH ₂), 3.43 – 3.45 (m, 1H, CH), 7.05 (t, <i>J</i> = 8.4 Hz, 2H, Ph-H), 7.35 (dd, <i>J</i> = 7.6, 1.6 Hz, 1H, Ph-H), 7.52 – 7.45 (m, 2H, Ph-H), 7.60 (dd, <i>J</i> = 8.5, 1.2 Hz, 1H), 7.71 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 8.01 (s, 1H, Ph-H), 8.62 (s, 1H, CONH), 8.69 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for C ₂₄ H ₁₆ ClF ₅ N ₃ O ([M + H] ⁺) 492, found 492.
I -47	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 0.75 – 0.77 (m, 2H, CH ₂), 0.98 – 1.01 (m, 2H, CH ₂), 3.43 – 3.46 (m, 1H, CH), 7.32 (dd, <i>J</i> = 8.4, 1.8 Hz, 1H, Ph-H), 7.38 (dd, <i>J</i> = 7.6, 1.2 Hz, 1H, Ph-H), 7.42 (dd, <i>J</i> = 8.4, 1.8 Hz, 1H, Ph-H), 7.62 (d, <i>J</i> = 8.6 Hz, 1H, Ph-H), 7.73 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.84 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H, Ph-H), 7.92 (d, <i>J</i> = 8.4 Hz, 1H, Ph-H), 8.11 (s, 1H, Ph-H), 8.70 (s, 1H, CONH), 8.77 (d, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for C ₂₄ H ₁₆ Cl ₃ F ₃ N ₃ O ([M + H] ⁺) 524, found 524.
I -48	¹ H NMR (600 MHz, CDCl ₃) δ: 0.75 – 0.77 (m, 2H, CH ₂), 0.98 – 1.01 (m, 2H, CH ₂), 3.44 – 3.47 (m, 1H, CH), 7.39 (dd, <i>J</i> = 7.6, 1.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.52 – 7.55 (m, 2H, Ph-H, pyridinyl-H), 7.63 (dd, <i>J</i> = 8.5, 1.3 Hz, 1H,

[0058]

	Ph-H), 7.73 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 8.10 (s, 1H, Ph-H), 8.23 (dd, $J = 8.3$, 2.6 Hz, 1H, pyridinyl-H), 8.55 (s, 1H, CONH), 8.69 (dd, $J = 8.3$, 1.4 Hz, 1H, Ph-H), 8.97 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H, pyridinyl-H); ESI-MS calcd for $C_{23}H_{16}Cl_2F_3N_4O$ ($[M + H]^+$) 491, found 491.
I -49	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 0.70 – 0.72 (m, 2H, cyclopropyl- CH_2), 0.93 – 0.96 (m, 2H, cyclopropyl- CH_2), 3.38 – 3.42 (m, 1H, cyclopropyl-CH), 1.22 – 1.28 (m, 2H, cyclohexyl- CH_2), 1.52 – 1.73 (m, 4H, cyclohexyl- CH_2), 1.83 – 1.86 (m, 2H, cyclohexyl- CH_2), 2.01 – 2.03 (m, 2H, cyclohexyl- CH_2), 2.34 – 2.39 (m, 1H, cyclohexyl-CH), 7.24 (dd, $J = 7.6$, 1.6 Hz, 1H, Ph-H), 7.39 (t, $J = 8.0$ Hz, 1H, Ph-H), 7.59 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.70 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.98 (s, 1H, Ph-H), 8.07 (s, 1H, CONH), 8.54 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for $C_{24}H_{24}ClF_3N_3O$ ($[M + H]^+$) 462, found 462.
I -50	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.97 (s, 3H, N- CH_3), 7.35 (td, $J = 7.4$, 1.4 Hz, 1H, Ph-H), 7.39 (td, $J = 7.6$, 1.8 Hz, 1H, Ph-H), 7.43 (dd, $J = 8.0$, 1.2 Hz, 1H, Ph-H), 7.51 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H, Ph-H), 7.55-7.58 (m, 3H, Ph-H), 7.74 (dd, $J = 7.5$, 1.5 Hz, 1H, Ph-H), 7.81 (d, $J = 7.3$ Hz, 1H, Ph-H), 8.06 (s, 1H, Ph-H), 8.17 (s, 1H, Ph-H), 8.43 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{24}H_{16}ClF_7N_3O$ ($[M + H]^+$) 530, found 530.
I -51	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.97 (s, 3H, N- CH_3), 7.39 (t, $J = 7.9$ Hz, 1H, Ph-H), 7.49 (ddd, $J = 8.0$, 2.0, 0.9 Hz, 1H, Ph-H), 7.52 – 7.58 (m, 4H, Ph-H), 7.75 (dt, $J = 7.7$, 1.2 Hz, 1H, Ph-H), 7.81 (dt, $J = 7.5$, 1.8 Hz, 1H, Ph-H), 7.84 (t, $J = 1.8$ Hz, 1H, Ph-H), 8.04 (s, 1H, Ph-H), 8.14 (s, 1H, Ph-H), 8.50 (s, 1H, NH, CONH); ESI-MS calcd for $C_{24}H_{16}ClF_7N_3O$ ($[M + H]^+$) 530, found 530.
I -52	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.94 (s, 3H, N- CH_3), 7.41 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H, Ph-H), 7.48 -7.52 (m, 3H, Ph-H), 7.58 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.74 -7.76 (m, 1H, Ph-H), 7.83 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H, Ph-H), 8.04 (s, 1H, Ph-H), 8.07 (s, 1H, Ph-H), 8.58 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{24}H_{16}ClF_7N_3O$

[0059]

	<p>$([M + H]^+)$ 530 , found 530.</p>
I -53	<p>^1H NMR (600 MHz, CDCl_3) δ: 3.95 (s, 3H, N-CH_3), 7.50 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H, Ph-H), 7.57 – 7.63 (m, 5H, Ph-H), 7.63 (d, $J = 7.3$ Hz, 1H, Ph-H), 7.72 (d, $J = 7.8$ Hz, 1, Ph-HH), 7.75 – 7.77 (m, 1H, Ph-H), 8.00 (s, 1H, Ph-H), 8.09 (s, 1H, Ph-H), 8.27 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $\text{C}_{25}\text{H}_{14}\text{F}_{10}\text{N}_3\text{O}$ ($[M - H]^-$) 562, found 562.</p>
I -54	<p>^1H NMR (600 MHz, CDCl_3) δ: 3.95 (s, 3H, N-CH_3), 7.50 – 7.54 (m, 3H, Ph-H), 7.59 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.71 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H, Ph-H), 7.81 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 7.97 – 8.00 (m, 3H, Ph-H), 8.09 (s, 1H, Ph-H), 8.85 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $\text{C}_{25}\text{H}_{16}\text{F}_7\text{N}_4\text{O}$ ($[M + H]^+$) 521, found 521.</p>
I -55	<p>^1H NMR (600 MHz, CDCl_3) δ: 3.92 (s, 3H, N-CH_3), 5.22 (s, 2H, O-CH_2), 6.93 (s, 1H, NH), 7.34 – 7.42 (m, 5H, Ph-H), 7.48 – 7.51 (m, 2H, Ph-H), 7.50 – 7.51 (s, 2H, Ph-H), 7.57 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.90 (s, 1H, Ph-H), 8.10 (s, 1H, Ph-H); ESI-MS calcd for $\text{C}_{25}\text{H}_{18}\text{F}_7\text{N}_3\text{O}_2$ ($[M + H]^+$) 526, found 526.</p>
I -56	<p>^1H NMR (600 MHz, CDCl_3) δ: 3.99 (s, 3H, N-CH_3), 7.32 (td, $J = 7.4, 1.5$ Hz, 1H, Ph-H), 7.35 (td, $J = 7.5, 1.8$ Hz, 1H, Ph-H), 7.38 (dd, $J = 7.8, 1.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.52 (d, $J = 8.3$ Hz, 1H, Ph-H), 7.54 – 7.58 (m, 2H, Ph-H), 7.66 (s, 1H, Ph-H), 7.70 (dd, $J = 7.5, 1.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.84 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H, Ph-H), 7.86 – 7.88 (m, 1H, Ph-H), 8.17 (s, 1H, Ph-H), 8.53 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $\text{C}_{24}\text{H}_{16}\text{ClF}_7\text{N}_3\text{O}$ ($[M + H]^+$) 530 , found 530.</p>
I -57	<p>^1H NMR (600 MHz, CDCl_3) δ: 3.98 (s, 3H, N-CH_3), 7.35 (t, $J = 7.9$ Hz, 1H, Ph-H), 7.44 (ddd, $J = 8.0, 2.0, 1.0$ Hz, 1H, Ph-H), 7.50 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H, Ph-H), 7.53 – 7.54 (m, 2H, Ph-H), 7.67 (s, 1H, Ph-H), 7.74 (dt, $J = 7.7, 1.2$ Hz, 1H, Ph-H), 7.80 – 7.84 (m, 3H, Ph-H), 8.13 (s, 1H, Ph-H), 8.75 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $\text{C}_{24}\text{H}_{16}\text{ClF}_7\text{N}_3\text{O}$ ($[M + H]^+$) 530, found 530.</p>
I -58	<p>^1H NMR (600 MHz, CDCl_3) δ: 3.99 (s, 3H, N-CH_3), 7.47 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H, Ph-H), 7.54 – 7.55 (m, 3H, Ph-H), 7.68 (s, 1H, Ph-H), 7.79 (dt, $J = 7.1, 2.0$ Hz, 1H, Ph-H), 7.85 (d, $J = 8.6$ Hz, 2H, Ph-H), 7.88 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H,</p>

	Ph-H), 8.10 (s, 1H, Ph-H), 8.26 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{24}H_{16}ClF_7N_3O$ ($[M + H]^+$) 530, found 530.
I -59	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.97 (s, 3H, N- CH_3), 7.50 (d, $J = 8.0$ Hz, 2H, Ph-H), 7.54 – 7.56 (m, 4H, Ph-H), 7.65-7.66 (m, 2H, Ph-H), 7.79 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H, Ph-H), 7.86 – 7.88 (m, 1H, Ph-H), 8.12 (s, 1H, Ph-H), 8.39 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{25}H_{14}F_{10}N_3O$ ($[M - H]^-$) 562, found 562.
[0060] I -60	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.99 (s, 3H, N- CH_3), 7.53 – 7.56 (m, 3H, Ph-H), 7.69 (s, 1H, Ph-H), 7.78 – 7.82 (m, 3H, Ph-H), 7.86 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H, Ph-H), 8.02 (d, $J = 8.4$ Hz, 2H, Ph-H), 8.09 (s, 1H, Ph-H), 8.52 (s, 1H, CONH); ESI-MS calcd for $C_{25}H_{16}F_7N_4O$ ($[M + H]^+$) 521, found 521.
I -61	1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ : 3.94 (s, 3H, N- CH_3), 5.23 (s, 2H, O- CH_2), 6.88 (s, 1H, NH), 7.34 – 7.43 (m, 5H, Ph-H), 7.48 – 7.49 (m, 2H, Ph-H), 7.54 (d, $J = 8.1$ Hz, 2H, Ph-H), 7.66 (s, 1H, Ph-H), 7.89 – 7.91 (m, 2H, Ph-H); ESI-MS calcd for $C_{25}H_{19}F_7N_3O_2$ ($[M + H]^+$) 526, found 526.

[0061] 实施例21对粘虫的杀虫活性

[0062] 各待测化合物用含1%吐温-80乳化剂的DMF溶解配制成质量浓度为2.5%母液,然后用适量蒸馏水稀释到200 μ g/mL备用。将适量玉米叶在配好的药液中充分浸润后自然阴干,放入垫有滤纸的培养皿中,接粘虫3龄中期幼虫20头/皿,置于24~27 $^{\circ}$ C观察室内培养,72h后调查结果。以毛笔触动虫体,无反应视为死虫。

[0063] 表3 N-(3-(苯并咪唑-2-基)苯基)酰胺类化合物杀粘虫活性

化合物	致死率(%)	化合物	致死率(%)	化合物	致死率(%)
I -1	30	I -22	62.5	I -43	25
I -2	22.5	I -23	25	I -44	90
[0064] I -3	0	I -24	40	I -45	27.5
I -4	22.5	I -25	95	I -46	32.5
I -5	25	I -26	40	I -47	35

[0065]

I -6	35	I -27	40	I -48	27.5
I -7	22.5	I -28	35	I -49	32.5
I -8	30	I -29	22.5	I -50	0
I -9	0	I -30	32.5	I -51	30
I -10	37.5	I -31	95	I -52	40
I -11	30	I -32	27.5	I -53	0
I -12	40	I -33	30	I -54	37.5
I -13	25	I -34	70	I -55	85
I -14	40	I -35	57.5	I -56	0
I -15	25	I -36	100	I -57	0
I -16	85	I -37	100	I -58	32.5
I -17	32.5	I -38	22.5	I -59	20
I -18	32.5	I -39	30	I -60	27.5
I -19	35	I -40	0	I -61	85
I -20	22.5	I -41	27.5		
I -21	35	I -42	17.5		

[0066] 结果显示表1中的大部分化合物在试验浓度200 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 下对粘虫具有一定的杀虫活性,其中化合物I-16、I-25、I-31、I-36、I-37、I-44、I-55和I-61在试验浓度200 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 下对粘虫表现出85%以上的致死率。

[0067] 实施例22对苜蓿蚜的杀虫活性

[0068] 各待测化合物用含1%吐温-80乳化剂的DMF溶解配制成质量浓度为2.5%母液,然后用适量蒸馏水稀释到200 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 备用。将接有苜蓿蚜的蚕豆叶片于Potter喷雾塔下喷雾处理,处理后苜蓿蚜置于20~22 $^{\circ}\text{C}$ 观察室内培养,72h后调查结果。以毛笔触动虫体,无反应视为死虫。

[0069] 表4 N-(3-(苯并咪唑-2-基)苯基)酰胺类化合物杀苜蓿蚜活性

[0070]

化合物	致死率(%)	化合物	致死率(%)	化合物	致死率(%)
I -1	20	I -22	65	I -43	20

[0071]

I -2	0	I -23	40	I -44	0
I -3	25	I -24	10	I -45	25
I -4	85	I -25	85	I -46	35
I -5	10	I -26	45	I -47	15
I -6	40	I -27	25	I -48	50
I -7	0	I -28	20	I -49	20
I -8	35	I -29	0	I -50	15
I -9	15	I -30	15	I -51	35
I -10	30	I -31	30	I -52	0
I -11	55	I -32	90	I -53	15
I -12	0	I -33	25	I -54	25
I -13	5	I -34	35	I -55	15
I -14	0	I -35	85	I -56	30
I -15	30	I -36	50	I -57	20
I -16	5	I -37	5	I -58	0
I -17	85	I -38	50	I -59	25
I -18	0	I -39	0	I -60	5
I -19	0	I -40	85	I -61	45
I -20	30	I -41	35		
I -21	50	I -42	30		

[0072] 结果显示表1中的大部分化合物在试验浓度200 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 下对苜蓿蚜具有一定的杀虫活性,其中化合物I-4、I-17、I-25、I-32、I-35和I-40在试验浓度200 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 下对苜蓿蚜表现出85%以上的致死率。

[0073] 实施例23对稻飞虱的杀虫活性

[0074] 各待测化合物用含1%吐温-80乳化剂的DMF溶解配制成质量浓度为2.5%母液,然后用适量蒸馏水稀释到200 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 备用。将4~6根水稻苗(长约3~4cm,室内培育)用白石英砂固定于 $\varnothing 7\text{ cm}$ 的培养皿内,接 CO_2 麻醉的水稻褐飞虱3龄中期若虫若干,置于Potter喷雾塔下定量喷雾处理(压力为51b/in²,沉降量为4.35mg/cm²),每处理重复3次,喷雾后用透明塑料杯罩住,放于观察室内(24~27 $^{\circ}\text{C}$,14h光照),72h后调查结果。调查时,以毛笔轻触虫体,无反应视为死虫。

[0075] 表5 N-(3-(苯并咪唑-2-基)苯基)酰胺类化合物杀稻飞虱活性

[0076]

化合物	致死率 (%)	化合物	致死率 (%)	化合物	致死率 (%)
I-1	40	I-22	20	I-43	35
I-2	30	I-23	35	I-44	0
I-3	25	I-24	20	I-45	25
I-4	65	I-25	20	I-46	25
I-5	30	I-26	10	I-47	45
I-6	45	I-27	85	I-48	40
I-7	95	I-28	30	I-49	35
I-8	95	I-29	10	I-50	35
I-9	40	I-30	60	I-51	30
I-10	95	I-31	15	I-52	0
I-11	45	I-32	20	I-53	40
I-12	35	I-33	15	I-54	65
I-13	30	I-34	20	I-55	15
I-14	0	I-35	0	I-56	0
I-15	40	I-36	30	I-57	20
I-16	15	I-37	90	I-58	0
I-17	25	I-38	10	I-59	25
I-18	0	I-39	30	I-60	0
I-19	45	I-40	35	I-61	15
I-20	85	I-41	20		
I-21	20	I-42	25		

[0077] 结果显示表1中的大部分化合物在试验浓度200 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 下对稻飞虱具有一定的杀虫活性,其中化合物I-7、I-8、I-10、I-20、I-27、和I-37在试验浓度200 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 下对稻飞虱表现出85%以上的致死率。

[0078] 本说明书所述的内容仅仅是对发明构思实现形式的列举,本发明的保护范围不应当被视为仅限于实施例所陈述的具体形式,本发明的保护范围也及于本领域技术人员根据本发明构思所能够想到的等同技术手段。