



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 102083818 B

(45) 授权公告日 2014. 08. 06

(21) 申请号 200980122738. 2

代理人 钟守期 王媛

(22) 申请日 2009. 06. 12

(51) Int. Cl.

(30) 优先权数据

C07D 403/04 (2006. 01)

08010947. 3 2008. 06. 17 EP

C07D 401/14 (2006. 01)

C07D 407/14 (2006. 01)

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

C07D 409/14 (2006. 01)

2010. 12. 16

C07D 417/14 (2006. 01)

(86) PCT国际申请的申请数据

A01N 43/56 (2006. 01)

PCT/EP2009/004232 2009. 06. 12

(87) PCT国际申请的公布数据

(56) 对比文件

W02009/152995 DE 2009. 12. 23

EP 0822187 A1, 1998. 04. 02, 全文.

CN 1492864 A, 2004. 04. 28, 全文.

(73) 专利权人 拜尔农作物科学股份公司

CN 1768051 A, 2006. 05. 03, 说明书摘要.

地址 德国蒙海姆

WO 2008/080504 A2, 2008. 07. 10, 说明书第 1-63 页.

(72) 发明人 H·詹科比 A·马特里提

CN 1929738 A, 2007. 03. 14, 权利要求 1-3 以

J·蒂布特 J·迪特根

及说明书第 21-50 页.

D·福伊希特 I·豪泽-哈恩

CN 101023078 A, 2007. 08. 22, 全文.

H·科恩 C·H·罗辛格

审查员 王维佳

(74) 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限

公司 11285

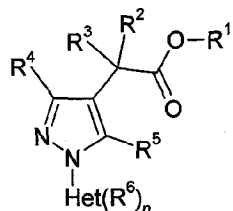
权利要求书3页 说明书170页

(54) 发明名称

被取代的 1-(二嗪基)吡唑-4-基-乙酸、其制备方法及其作为除草剂和植物生长调节剂的用途

(57) 摘要

本发明涉及通式 (I) 的 1-(3-二嗪基)吡唑-4-基-乙酸衍生物和其盐,

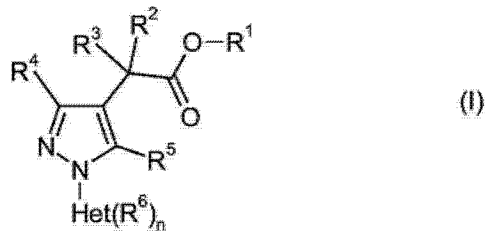


(I) 其中 Het、R¹、

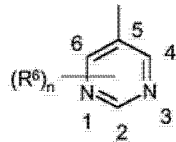
R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶及 n 如权利要求 1 定义。所述化合物 (I) 或其盐适于用作除草剂及植物生长调节剂,特别是作为用于选择性防治植物作物中杂草的除草剂,并且可根据权利要求 8 中所述的方法制备。

CN 102083818 B

1. 式(I)的化合物或其盐,



其中



Het 为

R^1 为氢, 或者为 (C_1-C_{18}) -烷基、 (C_2-C_{18}) -炔基或 (C_3-C_9) -环烷基, 其各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素和 (C_1-C_8) -烷基的基团所取代,

R^2 为氢,

R^3 为氢,

R^4 为氢、卤素、氰基、或 (C_1-C_6) -烷基,

R^5 为苯基或吡啶基、吡嗪基、异喹啉基、噻吩基、苯并噻唑基、或嘧啶基, 上述基团为未取代的或者被一个或多个选自以下的基团所取代: 卤素、硝基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基和 (C_1-C_6) -烷氧基, 并且

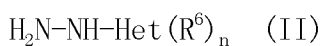
n 为 0。

2. 权利要求 1 的式(I)化合物或其盐, 其中

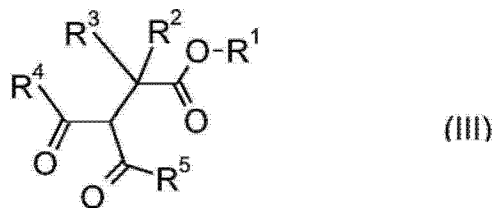
R^4 为氢、卤素、氰基或 (C_1-C_4) -烷基。

3. 一种制备权利要求 1 或 2 所定义的式(I)化合物或其盐的方法, 其中

(a) 使式(II)化合物与式(III)化合物反应以生成式(I)的化合物或其盐,

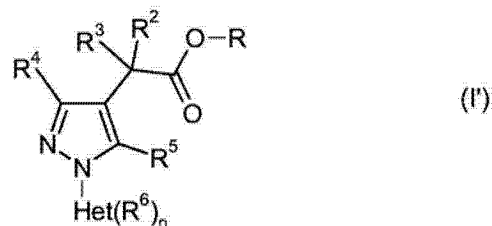


其中 Het 及 $(R^6)_n$ 如式(I)中的定义



其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及 R^5 如式(I)中的定义;

(b) 如果式(I)中的 R^1 不为氢, 则使式(I')的化合物



其中 Het、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及 $(R^6)_n$ 如式(I)中的定义且

R 为一个与基团 R^1 不同也不为 H 的选自如为 R^1 所定义基团的基团，

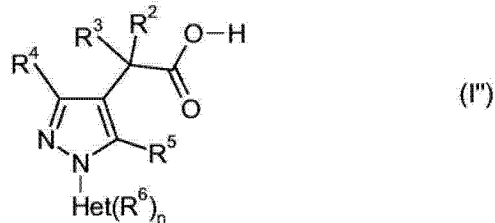
或其中 $R=H$ 的式(I')化合物的酸酐、酰基卤化物或活化酯，与式(IV)的化合物反应以生成式(I)的化合物，

R^1-OH (IV)

其中 R^1 如式(I)中的定义，

或者

(c) 如果式(I)中的 R^1 不为氢，则使式(I'')化合物——如果合适在酸基团活化之后——与式(IV)的化合物反应(酯化)以生成式(I)化合物，



其中 Het、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及 $(R^6)_n$ 如式(I)中的定义，

R^1-OH (IV)

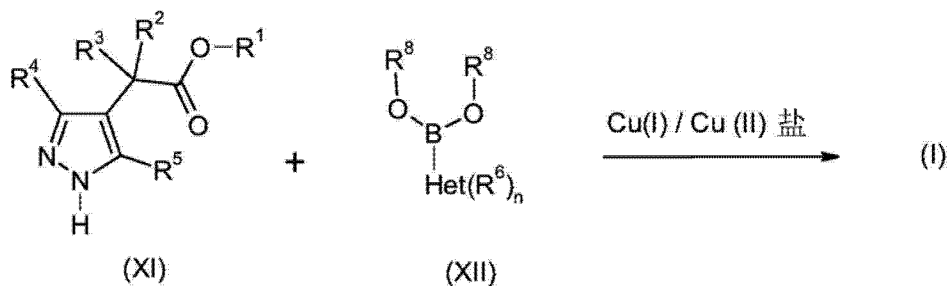
其中 R^1 如式(I)中的定义，

或者

(d) 如果制备其中 $R^1=H$ 的式(I)化合物或其盐，则使式(I')的化合物——见变型方案(b)中的定义——水解，生成式(I)化合物或其盐，

或者

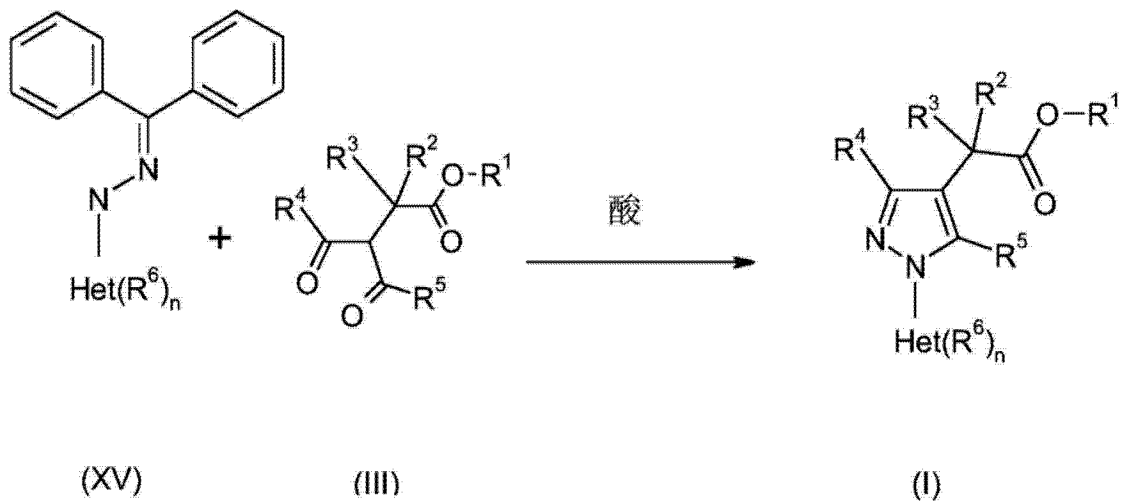
g) 使通式(XI)化合物与式(XII)的硼衍生物在 Cu(I) 盐或 Cu(II) 盐及一种有机碱的存在下——如果合适在一种溶剂中——反应，



其中在式(XI)及(XII)中，Het、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 $(R^6)_n$ 具有如以上对式(I)定义所给出的含义，并且 R^8 为 H 或 (C_1-C_6) -烷基或两个烷基基团 R^8 环状连接，

或者

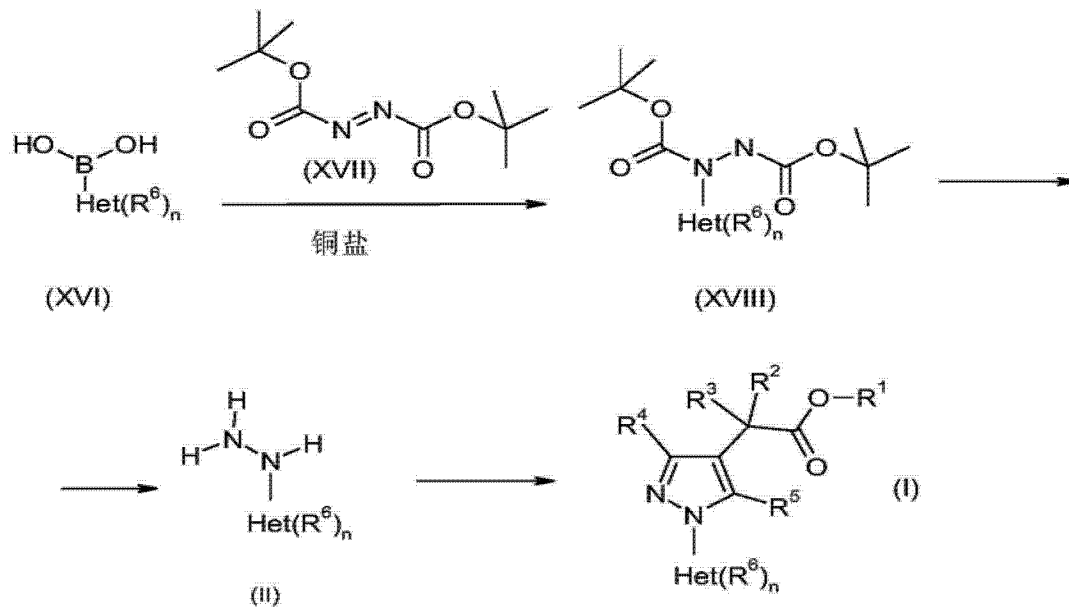
h) 使通式(XV)的化合物与通式(III)的化合物在一种酸的存在下——如果合适在一种溶剂中——反应以生成式(I)的化合物或其盐，



其中在式 (XV) 及 (III) 中, Het 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 $(\text{R}^6)_n$ 如式 (I) 中的定义, 且 LG 为一个离去基团,

或者

i) 使通式 (XVI) 的化合物与偶氮二羧酸二叔丁酯 (DBAD, XVII) 在一种铜盐存在下——任选地在一种溶剂中——反应, 以生成式 (XVIII) 的化合物, 其然后经由式 (II) 的化合物或其盐以及根据方法 a) 的方法转化为式 (I) 的化合物; 其中通式 (XVI) 中 $(\text{R}^6)_n$ 如式 (I) 中的定义, 式 (XVIII) 中 $(\text{R}^6)_n$ 如式 (I) 的定义, 式 (II) 中 $(\text{R}^6)_n$ 如式 (I) 中的定义:



4. 一种除草或植物生长调节组合物, 其包含一种或多种权利要求 1 或 2 的式 (I) 化合物或其盐以及作物保护中的常规制剂助剂。

5. 一种用于防治有害植物或调节植物生长的方法, 其包含将有效量的一种或多种权利要求 1 或 2 中定义的式 (I) 化合物或其盐施用于植物、植物种子或栽培区域。

6. 权利要求 5 的方法, 其中所述式 (I) 化合物或其盐用于防治有害植物或用于调节有益作物植物或观赏作物植物的生长。

7. 权利要求 6 的方法, 其中所述作物植物为转基因作物植物。

8. 权利要求 1 或 2 的式 (I) 化合物或其盐用作除草剂或植物生长调节剂的用途。

被取代的 1-(二嗪基)吡唑-4-基-乙酸、其制备方法及其 作为除草剂和植物生长调节剂的用途

[0001] 本发明涉及除草剂及植物生长调节剂技术领域,例如用于防治有益植物作物中阔叶杂草及禾本科杂草的除草剂,或可用于影响作物植物生长的植物生长调节剂。

[0002] 在它们的施用中,迄今已知的用于选择性防治有益植物作物中有害植物的作物保护剂或用于防治不想要的植物的活性化合物有时有一些缺点,即 (a) 其对特定有害植物没有除草活性或除草活性不足, (b) 可用活性化合物防治的有害植物谱不够宽, (c) 对有益植物作物的选择性太低或其具有毒理学上不利的概况 (profile)。可作为植物生长调节剂用于许多有益植物的其它活性化合物导致不期望发生的其它有益植物的减产或者与作物植物不相容,或者施用率范围窄。其它已知的活性化合物,由于前体及试剂难以获得或者其化学稳定性不足,还不能进行经济地工业规模生产。其他活性化合物的活性过于依赖环境条件,例如气候及土壤条件。

[0003] 具有除草活性的 3-(杂)芳基-4-[(杂)芳基羰基]吡唑化合物已知于 EP-A-0822187 以及其中引用的文献。

[0004] US 4146721 公开了作为镇痛药、解热药及抗炎药的吡唑基乙酸;然而作为农药、特别是除草剂的用途还未进行描述。

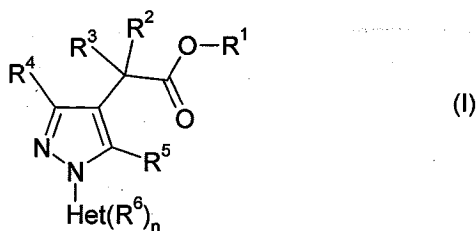
[0005] US 4,095,025 公开了用于药学(例如抗炎)目的的 1,3-二芳基吡唑-4-丙烯酸及其衍生物。

[0006] WO 2004/089931 公开了受到 5HT 受体结合的调控而用于治疗 and 预防疾病的被取代的吡唑,其在吡唑的 1 位氮原子处有任选取代的苯基或吡啶-3-基基团。

[0007] 出于所述原因,仍需要用于植物作物中选择性施用以及用于非耕地的高活性替代除草剂。还需要制备具有化学活性的替代化合物,其——如果合适——可有利地用作除草剂或植物生长调节剂。

[0008] 本发明提供了式 (I) 的化合物及其盐

[0009]



[0010] 其中

[0011] Het 为含有两个杂原子作为环原子的六元杂芳族基团,其中环中杂原子为氮原子,并且环中至少一个氮原子位于与吡唑基相连的环碳原子的 1,3-位,

[0012] R¹ 为氢或可水解基团,优选氢或任选取代的烷基或任选取代的杂环基,其中最后提及的两种含碳基团包括取代基在内各自含有 1 至 30 个碳原子、优选 1 至 24 个碳原子、特别是 1 至 20 个碳原子,或

[0013] 式 $\text{SiR}^a\text{R}^b\text{R}^c$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^b$ 或 $-\text{N} = \text{CR}^c\text{R}^d$ 的基团,

[0014] 其中,在最后提及的三个式子中,基团 R^a 、 R^b 、 R^c 以及 R^d 各自彼此独立地为氢或任选取代的烃基;或者 R^a 及 R^b 与氮原子一起为一个 3 至 9 元杂环,所述杂环除了所述氮原子外,还可包含一个或两个选自 N、O 及 S 的其它环杂原子,并且其为未取代的或取代的;或者 R^c 及 R^d 与碳原子一起为一个 3 至 9 元碳环基或可包含 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子的杂环基,其中所述碳环或杂环基为未取代的或取代的,

[0015] 其中所述基团 R^a 、 R^b 、 R^c 及 R^d 包括取代基在内各自含有最高达 30 个碳原子、优选地最高达 24 个碳原子、特别是最高达 20 个碳原子,

[0016] R^2 为氢、卤素,或者未取代的或被一个或多个选自卤素、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷硫基和 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷氧基的基团所取代的 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -烷基,

[0017] R^3 为氢、卤素,或者未取代的或被一个或多个选自卤素、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷硫基及 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷氧基的基团所取代的 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -烷基,或

[0018] R^2 和 R^3 与它们所连接的碳原子一起为含有 3 至 6 个碳原子的饱和或部分不饱和和碳环,所述碳环为未取代的或者被一个或多个选自卤素及 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷基的基团所取代,并且

[0019] R^4 为氢、卤素、氰基、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -烷基、 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$ -烯基或 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$ -炔基,其中最后提及的三种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自以下的基团取代:卤素、氰基、羟基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基- $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷硫基以及任选被卤素、氰基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷基或 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷基取代的 $(\text{C}_3\text{-C}_9)$ -环烷基;或者优选地为未取代的或者被一个或多个选自以下的基团取代:卤素、氰基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基- $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷硫基以及任选被卤素、氰基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷基或 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷基取代的 $(\text{C}_3\text{-C}_9)$ -环烷基,或者

[0020] $(\text{C}_3\text{-C}_9)$ -环烷基、 $(\text{C}_5\text{-C}_9)$ -环烯基或 $(\text{C}_5\text{-C}_9)$ -环炔基,其中最后提及的三种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷基、 $(\text{C}_2\text{-C}_4)$ -烯基、 $(\text{C}_2\text{-C}_4)$ -炔基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷氧基及 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷硫基的基团所取代,或者

[0021] 苯基,其为未取代的或者被一个或多个选自卤素、氰基、硝基、羧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷基、 $(\text{C}_2\text{-C}_4)$ -烯基、 $(\text{C}_2\text{-C}_4)$ -炔基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基- $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷硫基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷酰基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷酰基、 $[(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基]羰基以及 $[(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷氧基]羰基的基团所取代,或者

[0022] $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -烷酰基,其为未取代的或者被一个或多个选自卤素、氰基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基- $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷硫基以及任选被卤素、氰基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷基或 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷基取代的 $(\text{C}_3\text{-C}_6)$ -环烷基的基团所取代,或者 $[(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基]羰基,其为未取代的或者被一个或多个选自卤素、氰基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基- $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷硫基以及任选被卤素、氰基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷基或 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷基取代的 $(\text{C}_3\text{-C}_6)$ -环烷基的基团所取代,或者

[0023] $[(\text{C}_3\text{-C}_9)$ -环烷氧基]羰基,其为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷基、 $(\text{C}_2\text{-C}_4)$ -烯基、 $(\text{C}_2\text{-C}_4)$ -炔基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷氧基及 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷硫基的基团所取代,

[0024] R^5 为芳基,其为未取代的或取代的,并且包括取代基在内含有 6 至 30 个碳原子、优

选地 6 至 24 个碳原子、特别是 6 至 20 个碳原子,或

[0025] 一个含有 1 至 4 个选自 N、O 及 S 的环杂原子的杂芳族基团,其为未取代的或取代的,并且包括取代基在内含有 1 至 30 个碳原子、优选地 1 至 24 个碳原子、特别是 1 至 20 个碳原子,并且

[0026] $(R^6)_n$ 为 n 个取代基 R^6 , 其中 R^6 ——在 $n = 1$ 的情况下——为或各个取代基 R^6 彼此独立地——在 n 大于 1 的情况下——为卤素、羟基、氨基、硝基、羧基、氰基、氨基甲酰基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (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、单或二 [(C_1-C_4) -烷基] 氨基烷基、羟基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -卤代烯基、 (C_2-C_6) -炔基、 (C_2-C_6) -卤代炔基、 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -烷硫基、 (C_1-C_6) -卤代烷硫基、[(C_1-C_6)-烷氧基] 羰基、[(C_1-C_6)-卤代烷氧基] 羰基、 (C_1-C_6) -烷酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷酰基、单或二 [(C_1-C_4)-烷基] 氨基羰基、单或二 [(C_1-C_6)-酰基] 氨基、单或二 [(C_1-C_4)-烷基] 氨基、N-[(C_1-C_6)-酰基]-N-[(C_1-C_6)-烷基] 氨基、 (C_1-C_6) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷基磺酰基、 (C_3-C_9) -环烷基或 (C_5-C_9) -环烯基,其中最后提及的两种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷基及 (C_1-C_4) -卤代烷基的基团所取代,并且

[0027] n 为 0、1、2 或 3。

[0028] 通过将合适的无机酸或有机酸——例如 HCl、HBr、 H_2SO_4 或 HNO_3 以及草酸或磺酸——加成到碱性基团(例如氨基或烷氨基)上,式(I)的化合物可形成盐。以脱质子化形式存在的合适取代基(例如磺酸或羧酸)可与本身可质子化的基团(例如氨基)形成内盐。盐也可通过将合适取代基(例如磺酸或羧酸)的氢用农业上合适的阳离子代替而形成。所述盐为例如,金属盐,特别是碱金属盐或碱土金属盐,尤其是钠盐及钾盐;或铵盐,与有机胺形成的盐或季铵盐。

[0029] 在式(I)及所有随后式子中,使用具有特别是如下所示例说明的含意的化学基团术语。

[0030] 可水解基团(见 R^1 的定义)为可在施用条件下水解的基团,例如即使在喷雾液中或特别是在植物生理条件下可水解的基团,其中含有羧酸酯基团 $-CO-OR^1$ (R^1 不是氢)的式(I)化合物水解成含有羧酸基团 $-CO-OH$ 的式(I)化合物(即,其中 $R^1 = H$ 的化合物(I))。明确地,可水解基团的定义还包括其中 $R^1 =$ 烃基或杂环基的基团,其中最后提及的两种基团为未取代的或取代的,即使其中一些可较慢地水解。

[0031] 烃基为基于元素碳和氢的脂族、脂环族或芳香族单环或(在任选取代的烃基的情况下)为双环或多环的有机基团,其包括例如烷基、烯基、炔基、环烷基、环烯基、芳基、苯基、萘基、2,3-二氢化茛基、茛基等;这相应地适用于在复合含义中的烃基,例如烃氧基(hydrocarbonoxyradical)或其它经由杂原子基团连接的烃基中的烃基。

[0032] 除非更具体地定义,所述烃基优选地含有 1 至 20 个碳原子、更优选地 1 至 16 个碳原子、特别是 1 至 12 个碳原子。

[0033] 所述烃基——也指具体的烷基、烷氧基、卤代烷基、卤代烷氧基、烷氨基及烷硫基以及相应的不饱和基团/或被取代的基团中的烃基——各自在碳骨架中可为直链或支链的。

[0034] 表述“(C₁-C₄)-烷基”是对含有 1 至 4 个碳原子的烷基的简单表示,即包括甲基、乙基、1-丙基、2-丙基、1-丁基、2-丁基、2-甲基丙基或叔丁基。含有更大指定碳原子范围的宽泛的烷基(例如“(C₁-C₆)-烷基”)相应地也包括含有更多碳原子的直链或支链烷基,即根据所述实例,还有含 5 和 6 个碳原子的烷基。

[0035] 除非特别说明,优选较低碳骨架,例如含有 1 至 6 个碳原子的、或在饱和基团的情况下、在烃基(例如烷基、烯基及炔基)的情况下——包括结合基团中的基团——含有 2 至 6 个碳原子的。烷基,包括结合定义(例如烷氧基、卤代烷基等)中的烷基,为例如甲基、乙基、正或异丙基、正、异、叔或 2-丁基、戊基、己基(例如正己基、异己基及 1,3-二甲基丁基)、庚基(例如正庚基、1-甲基己基及 1,4-二甲基戊基);烯基及炔基定义为对应于所述烷基的可能的不饱和基团;烯基为,例如乙烯基、烯丙基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、2-丁烯基、戊烯基、2-甲基戊烯基或己烯基,优选烯丙基、1-甲基丙-2-烯-1-基、2-甲基丙-2-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、丁-3-烯-1-基、1-甲基丁-3-烯-1-基或 1-甲基丁-2-烯-1-基。

[0036] 烯基还包括特别是含有多于一个双键的直链或支链烃基,例如 1,3-丁二烯基及 1,4-戊二烯基;还有含有一个或多个累积双键(cumulat ed double bond)的丙二烯基(allenyl)或累积多烯基(cumulenyl),例如丙二烯基(1,2-丙二烯基)、1,2-丁二烯基、1,2,3-戊三烯基。

[0037] 炔基为例如炔丙基、丁-2-炔-1-基、丁-3-炔-1-基、1-甲基丁-3-炔-1-基。炔基还包括特别是含有多于一个三键或者含有一个或多个三键及一个或多个双键的直链或支链烃基,例如 1,3-丁三烯基或 3-戊烯-1-基炔-1-基(3-penten-1-yn-1-yl)。

[0038] 3 至 9 元碳环为(C₃-C₉)-环烷基或(C₅-C₉)-环烯基。(C₃-C₉)-环烷基为含有优选 3-9 个碳原子的碳环饱和环体系,例如环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基、环辛基或环壬基。在被取代的环烷基的情况下,含有取代基的环状体系也包括在内,其中所述取代基也可通过双键键合到环烷基上,例如次烷基(alkylidene),例如次甲基(methylidene)。

[0039] (C₅-C₉)-环烯基为碳环的、含有 5-9 个碳原子的非芳香性的、部分饱和环状体系,例如 1-环丁烯基、2-环丁烯基、1-环戊烯基、2-环戊烯基、3-环戊烯基或 1-环己烯基、2-环己烯基、3-环己烯基、1,3-环己二烯基或 1,4-环己二烯基。在被取代的环烯基的情况下,被取代的环烷基的解释相应适用。

[0040] 次烷基——例如也指(C₁-C₁₀)-次烷基形式的次烷基——为通过双键键合的直链或支链烷的基团,其中键合位置并不固定。在支链烷的情况下,当然,只有其上两个氢原子可被双键代替的位置是可能的;基团为例如=CH₂、=CH-CH₃、=C(CH₃)-CH₃、=C(CH₃)-C₂H₅或=C(C₂H₅)-C₂H₅。

[0041] 卤素为例如氟、氯、溴或碘。卤代烷基、卤代烯基和卤代炔基各自为被相同或不同的卤原子——优选选自氟、氯及溴,特别是选自氟及氯——部分或完全取代的烷基、烯基和炔基,例如单卤代烷基、全卤代烷基、CF₃、CHF₂、CH₂F、CF₃CF₂、CH₂FCHCl、CCl₃、CHCl₂、CH₂CH₂Cl;卤代烷氧基为例如OCF₃、OCHF₂、OCH₂F、CF₃CF₂O、OCH₂CF₃及OCH₂CH₂Cl;上述内容同样适用于卤代烯基和其它卤代基团。

[0042] 芳基为单、二或多环芳香族体系,例如苯基、萘基、四氢萘基、茛基、2,3-二氢茛基、并环戊二烯基(pentalenyl)、茆基等,优选苯基。

[0043] 任选取代的芳基还包括多环体系例如四氢萘基、茛基、2,3-二氢化萘基、茛基、联苯基,其中连接点位于芳香体系上。

[0044] 杂环基团(杂环基)包含至少一个杂环(=其中至少一个碳原子被一个杂原子、优选地被选自N、O、S、P、B、Si、Se的杂原子代替的碳环),其为饱和的、不饱和的或杂芳族的,并且其可为未取代的或取代的,其中连接点位于环原子上。

[0045] 除非另作定义,杂环中优选包含一个或多个、特别是1、2或3个杂原子,杂原子优选地选自N、O及S;优选地,所述杂环基为含有3至7个环原子的脂族杂环基或者含有5或6个环原子的杂芳族基团。所述杂环基可例如为一个杂芳族基团或环(杂芳基),如单、双或多环芳香族体系,其中至少1个环包含一个或多个杂原子。

[0046] 如果所述杂环基团或杂环为任选取代的,其可稠合至其它碳环或杂环上。优选苯并稠合杂环或杂芳环。

[0047] 任选取代的杂环基还包括多环体系,例如8-氮杂双环[3.2.1]辛基或1-氮杂双环[2.2.1]庚基。

[0048] 任选取代的杂环还包括螺环体系,例如1-氧杂-5-氮杂-螺[2.3]己基。

[0049] 优选含有一个选自N、O及S的杂原子的杂芳环基团,例如五或六元环基团,如吡啶基、吡咯基、噁吩基或呋喃基;

[0050] 此外,还优选含有2、3或4个杂原子的相应杂芳环的基团,例如嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、三嗪基、四嗪基、噻唑基、噻二唑基、噁唑基、异噁唑基、吡唑基、咪唑基或三唑基或四唑基。

[0051] 在此,优选含有1至4个杂原子的五或六元杂芳环基团,例如,1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、四唑基、异噻唑基、1,2,3-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、四唑基、1,2,3-三嗪基、1,2,4-三嗪基、1,3,5-三嗪基、1,2,3,4-四嗪基、1,2,3,5-四嗪基、1,2,4,5-四嗪基、噻唑基、异噻唑基、噁唑基、异噁唑基、吡唑基、咪唑基。

[0052] 此处更优选含有3个氮原子的五元杂环的杂芳族基团,例如1,2,3-三唑-1-基、1,2,3-三唑-4-基、1,2,3-三唑-5-基、1,2,5-三唑-1-基、1,2,5-三唑-3-基、1,3,4-三唑-1-基、1,3,4-三唑-2-基、1,2,4-三唑-3-基、1,2,4-三唑-5-基;

[0053] 还更优选含有3个氮原子的六元杂环的杂芳族基团,例如1,3,5-三嗪-2-基、1,2,4-三嗪-3-基、1,2,4-三嗪-5-基、1,2,4-三嗪-6-基、1,2,3-三嗪-4-基、1,2,3-三嗪-5-基;

[0054] 还更优选含有2个氮原子和1个氧原子的五元杂环的杂芳族基团,例如1,2,4-噁二唑-3-基;1,2,4-噁二唑-5-基、1,3,4-噁二唑-2-基、1,2,3-噁二唑-4-基、1,2,3-噁二唑-5-基、1,2,5-噁二唑-3-基,

[0055] 还更优选含有两个氮原子和一个硫原子的五元杂环的杂芳族基团,例如1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,3,4-噻二唑-2-基、1,2,3-噻二唑-4-基、1,2,3-噻二唑-5-基、1,2,5-噻二唑-3-基;

[0056] 还更优选含有四个氮原子的五元杂环的杂芳族基团,例如1,2,3,4-四唑-1-基、1,2,3,4-四唑-5-基、1,2,3,5-四唑-1-基、1,2,3,5-四唑-4-基、2H-1,2,3,4-四唑-5-基、1H-1,2,3,4-四唑-5-基,

[0057] 还更优选六元杂环的杂芳族基团,例如 1,2,4,5-四嗪-3-基;

[0058] 还更优选含有三个氮原子和一个氧原子或硫原子的五元杂环的杂芳族基团,例如 1,2,3,4-噁三唑-5-基;1,2,3,5-噁三唑-4-基;1,2,3,4-噻三唑-5-基;1,2,3,5-噻三唑-4-基;

[0059] 还更优选六元杂环的杂芳族基团,例如 1,2,4,6-噻三嗪-1-基;1,2,4,6-噻三嗪-3-基;1,2,4,6-噻三嗪-5-基。

[0060] 此外,优选含有一个选自 N、O 及 S 的杂原子的部分氢化或完全氢化的杂环基团的杂环基团或环,例如环氧乙烷基、氧杂环丁烷基、氧杂环戊烷基(=四氢呋喃基)、噁烷基、吡咯啉基、吡咯烷基或哌啶基。

[0061] 此外,还优选含有两个选自 N、O 及 S 的杂原子的部分氢化或完全氢化的杂环基团,例如哌嗪基、二氧戊环基、噁唑啉基、异噁唑啉基、噁唑烷基、异噁唑烷基及吗啉基。适合用于被取代的杂环基的取代基还有以下提及的其它取代基以及另外的氧基(oxo)。所述氧基还可存在于可以多种氧化态形式存在的环杂原子上,例如在 N 及 S 上。

[0062] 杂环基的优选实例为含有 3 至 6 个环原子的杂环基团,选自吡啶基、噻吩基、呋喃基、吡咯基、环氧乙烷基、2-氧杂环丁烷基、3-氧杂环丁烷基、氧杂环戊烷基(=四氢呋喃基)、吡咯烷基、哌啶基,特别是环氧乙烷基、2-氧杂环丁烷基、3-氧杂环丁烷基或氧杂环戊烷基;或含有两或三个杂原子的杂环基团,例如嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、三嗪基、噻唑基、噻二唑基、噁唑基、异噁唑基、吡唑基、三唑基、哌嗪基、二氧杂环戊烷基、噁唑啉基、异噁唑啉基、噁唑烷基、异噁唑烷基或吗啉基。

[0063] 优选的杂环基团还包括苯并稠合杂芳环,例如苯并呋喃基、苯并异呋喃基、苯并噻吩基、苯并异噻吩基、异苯并噻吩基、吡啶基、异吡啶基、吡唑基、苯并咪唑基、苯并三唑基、苯并噁唑基、1,2-苯并异噁唑基、2,1-苯并异噁唑基、苯并噻唑基、1,2-苯并异噻唑基、2,1-苯并异噻唑基、1,2,3-苯并噁二唑基、2,1,3-苯并噁二唑基、1,2,3-苯并噻二唑基、2,1,3-苯并噻二唑基、喹啉基、异喹啉基、肉喹啉基、2,3-二氮杂萘基、喹唑啉基、喹喔啉基、1,5-二氮杂萘基、苯并三嗪基、嘌呤基、蝶啶基、中氮茛基、苯并-1,3-二氧基、4H-苯并-1,3-二氧基及 4H-苯并-1,4-二氧基,并且,如果可能,为它们的 N-氧化物及盐。

[0064] 当一个基础结构“被一个或多个选自一系列基团或宽泛定义的基团”取代时,其各自包括被多个相同和/或不同结构的基团同时取代。

[0065] 被取代的基团(例如被取代的烷基、烯基、炔基、环烷基、芳基、苯基、苄基、杂环基及杂芳基基团)为例如由未取代的基础结构衍生而来的被取代的基团,其中所述取代基为如一个或多个——优选 1、2 或 3 个——选自卤素、烷氧基、烷硫基、羟基、氨基、硝基、羧基、氰基、叠氮基、烷氧基羰基、烷基羰基、甲酰基、氨基甲酰基、单和二烷基氨基羰基、被取代的氨基(如酰氨基、单和二烷基氨基),及烷基亚磺酰基、烷基磺酰基,以及在环状基团的情况下还为烷基、卤代烷基、烷硫基烷基、烷氧基烷基、任选取代的单和二烷基氨基烷基及羟烷基;术语“被取代的基团”——例如被取代的烷基等——中,取代基包括,除了所述饱和烃基以外,相应的不饱和脂族及芳香族基团,例如任选取代的烯基、炔基、烯氧基、炔氧基、苯基、苯氧基等。在环中含有脂族部分的被取代的环状基团还包括含有那些通过双键键合在环上的取代基的环状体系,例如被次烷基基团——例如次甲基或次乙基——取代的。

[0066] 以实例方式提及的取代基(“第一取代层级”),当其包含烃部分时,可任选地被进

一步取代(“第二取代层级”),例如被一个针对第一取代层级所定义的取代基所取代。相应的其它取代层级是可能的。术语“被取代的基团”优选地包括仅一个或两个取代层级。

[0067] “基础基团”指与一个取代层级的取代基连接的一个基团的各个基础结构。

[0068] 用于所述取代层级的优选取代基为例如,

[0069] 氨基、羟基、卤素、硝基、氰基、巯基、羧基、碳酰胺、 SF_5 、氨基磺酰基、烷基、环烷基、烯基、环烯基、炔基、单烷基氨基、二烷基氨基、N-烷基氨基、烷氧基、烯氧基、炔氧基、环烷氧基、环烯氧基、烷氧基羰基、烯氧基羰基、炔氧基羰基、芳氧基羰基、烷酰基、烯基羰基、炔基羰基、芳基羰基、烷硫基、环烷基硫基、烯基硫基、环烯基硫基、炔基硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、单烷基氨基磺酰基、二烷基氨基磺酰基、N-烷基氨基羰基、N,N-二烷基氨基羰基、N-烷基氨基羰基、N-烷基氨基羰基、芳基、芳氧基、苄基、苄氧基、苄硫基、芳基硫基、芳基氨基及苄基氨基。

[0070] 还可是两个取代基一起形成一个饱和或不饱和的烃桥键,或者一个其中碳原子、CH基团或 CH_2 基团被杂原子代替的相应桥键,从而形成一个稠合环。此处优选的为基于基础结构的苯并稠合体系。

[0071] 任选取代的苯基优选地为苯基或者未取代的或被一个或多个选自卤素、氰基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基- $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基- $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷硫基及硝基的基团所取代的苯基,特别是任选地被一个或多个选自卤素、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷基及 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基的基团所取代的苯基。

[0072] 在含有碳原子的基团的情况下,优选的为含有1至6个碳原子、优选地1至4个碳原子、特别是1或2个碳原子的那些。一般而言,优选的取代基为选自卤素(例如氟和氯)、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷基(优选甲基或乙基)、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷基(优选三氟甲基)、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷氧基(优选甲氧基或乙氧基)、 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -卤代烷氧基、硝基和氰基的那些。特别优选的为取代基甲基、甲氧基、氟和氯。

[0073] 被取代的氨基(例如单取代或二取代的氨基)为选自被N-取代的被取代的氨基的基团,例如,被一个或两个选自烷基、烷氧基、酰基及芳基的相同或不同基团所取代;优选为单烷基氨基及二烷基氨基、单芳基氨基及二芳基氨基、酰氨基、N-烷基-N-芳基氨基、N-烷基-N-酰氨基及N-杂环;优选含有1至4个碳原子的烷基;芳基优选地为苯基或被取代的苯基;酰基的定义如下,优选为 $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ -烷酰基。上述内容同样适用于被取代的羟基氨基或胍基。

[0074] 酰基为这样一种有机酸的基团,其在形式上是通过将酸官能团上的一个羟基基团移除而产生的,在所述酸中的有机基团也可通过一个杂原子与所述酸官能团键合。酰基的实例为羧酸 HO-CO-R 的 $-\text{CO-R}$ 基团及所述羧酸衍生酸的基团,例如硫代羧酸、任选被N-取代的亚氨基羧酸的那些基团或碳酸单酯、被N-取代的氨基甲酸、磺酸、亚磺酸、被N-取代的氨基磺酸(sulfonamide acid)、磷酸或次磷酸的基团。

[0075] 酰基为,例如甲酰基、烷基羰基(如 $[(\text{C}_1\text{-C}_4)\text{-烷基}]$ 羰基)、苯基羰基、烷氧基羰基、苯氧基羰基、苄氧基羰基、烷基磺酰基、烷基亚磺酰基、N-烷基-1-亚氨基烷基及其它有机酸的基团。所述基团在烷基或苯基部分中可各自被进一步取代,例如在烷基部分中被一个或多个选自卤素、烷氧基、苯基及苯氧基的基团取代;苯基部分中取代基的实例为以上已

宽泛提及的用于被取代的苯基的取代基。

[0076] 酰基优选地为狭义的酰基基团,即这样一种有机酸的基团,其中所述酸基团与有机基团的碳原子直接键合;酰基例如甲酰基、烷基羰基(例如乙酰基或[(C₁-C₄)-烷基]羰基)、苯基羰基、烷基磺酰基、烷基亚磺酰基及其它有机酸的基团。

[0077] 更优选地,酰基为含有1至6个碳原子、特别是1至4个碳原子的烷酰基基团。此处,(C₁-C₄)-烷酰基为含有1至4个碳原子的链烷酸在移除酸基团的OH基团之后的基团,例如甲酰基、乙酰基、正丙酰基、异丙酰基或者正、异、仲或叔丁酰基。

[0078] 基团的“-基位”表示具有自由键的碳原子。本发明的式(I)化合物及本发明所使用的式(I)化合物(及,如果合适,其盐)也简称为“化合物(I)”。

[0079] 本发明还提供由式(I)所涵盖的所有立体异构体及其混合物。所述式(I)的化合物包含一个或多个不对称碳原子或者未在通式(I)中具体说明的双键。由具体的三维形状而定义的可能的立体异构体(例如对映异构体、非对映异构体、Z异构体及E异构体)均由式(I)涵盖,并且可由所述立体异构体的混合物通过常规方法获得,或通过立体选择性反应结合使用立体化学纯的起始原料来制备。

[0080] 本发明还提供了式(I)化合物的所有互变异构体,其可移动氢原子而形成(例如酮/烯醇互变异构体)。所述互变异构体也包括在式(I)化合物中,即使形式上式(I)仅正确地描述平衡中的一个互变异构体或可互变的互变异构体之一。

[0081] 式(I)的化合物还包括所有物理形式,其中这些化合物可以纯物质或任选以与其它化合物的混合物的形式存在,特别是以式(I)化合物的多晶型晶体形式或者其盐或溶剂合物(例如水合物)的形式。

[0082] 特别是为了获得更高的除草作用、更好的选择性及/或更好的可制备性,特别关注这样的本发明的式(I)化合物或其盐及其本发明的用途,其中各个基团含有以上或下文已提到的优选定义之一,或尤其是其中上述或下文已提到的优选定义中的一个或多个结合存在的那些。

[0083] 不管各自选自R¹、R²、R³、R⁴、R⁵及(R⁶)_n的其它基团,及对应于宽泛基团的子定义(subdefinition),以及优选地与所述基团中一个或多个的优选定义相结合,特别关注的本发明化合物或化合物的本发明用途是具有一列所述基团优选定义的那些。

[0084] 优选这样的本发明式(I)化合物或其盐,其中

[0085] R¹为氢、烷基、烯基、炔基、环烷基、环烯基、环炔基或芳基,其中最后提及的7种基团各自为未取代的或取代的,并且包括取代基在内含有最高达30个碳原子、优选最高达24个碳原子、特别是最高达20个碳原子,或

[0086] 这样一个含有3至9个环原子的杂环基基团,其包含1至4个选自N、O及S的杂原子,其为未取代的或取代的,并且包括取代基在内含有1至30个碳原子、优选1至24个碳原子、特别是1至20个碳原子。

[0087] 在此,更优选如下的化合物(I)或其盐,其中

[0088] R¹为氢。

[0089] 在此,更优选的还有化合物(I)或其盐,其中

[0090] R¹为H、(C₁-C₁₈)-烷基、(C₂-C₁₈)-烯基、(C₂-C₁₈)-炔基、(C₃-C₉)-环烷基、(C₅-C₉)-环烯基、(C₅-C₉)-环炔基或苯基,其中最后提及的7种基团各自为未取代的或取代的,并且包

括取代基在内含有最高达 30 个碳原子、优选地最高达 24 个碳原子、特别是最高达 20 个碳原子。

[0091] 在此,更优选地还有化合物 (I) 或其盐,其中

[0092] R^1 为 H、 (C_1-C_{18}) -烷基、 (C_2-C_{18}) -烯基、 (C_2-C_{18}) -炔基、 (C_3-C_9) -环烷基、 (C_5-C_9) -环烯基、 (C_5-C_9) -环炔基或苯基,

[0093] 其中最后提及的 7 种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、氰基、硫基、硝基、羟基以及羧基、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_1-C_8) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_8) -烯基、 (C_2-C_8) -卤代烯基、 (C_2-C_8) -炔基、 (C_2-C_8) -卤代炔基的基团所取代,最后提及的 7 种基团仅在环状基础基团的情况下为 (C_1-C_8) -烷氧基、 (C_2-C_8) -烯氧基、 (C_2-C_8) -炔氧基、 (C_1-C_8) 卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_8) -烷硫基、 (C_2-C_8) -烯硫基、 (C_2-C_8) -炔硫基,式 $-NR^*R^{**}$ 、 $-CO-NR^*R^{**}$ 及 $-O-CO-NR^*R^{**}$ 的基团,

[0094] 其中最后提及的三个式子中基团 R^* 及 R^{**} 各自彼此独立地为 H、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_2-C_8) -烯基、 (C_2-C_8) -炔基、苄基、被取代的苄基、苯基或被取代的苯基;或与氮原子一起为一个 3 至 8 元杂环,所述杂环除了氮原子之外,还可包含一个或两个选自 N、O 及 S 的其它环杂原子,并且其为未取代的或者被一个或多个选自 (C_1-C_4) -烷基及 (C_1-C_4) -卤代烷基的基团所取代,

[0095] 以及 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]硫代羰基、 $[(C_2-C_8)$ 烯氧基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ -炔氧基]羰基、 $[(C_1-C_8)$ -烷硫基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ -烯硫基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ -炔硫基]羰基、 (C_1-C_8) -烷酰基、 $[(C_2-C_8)$ -烯基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ 炔基]羰基、 (C_1-C_4) -烷基亚氨基、 (C_1-C_4) -烷氧基亚氨基、 $[(C_1-C_8)$ -烷基]羰基氨基、 $[(C_2-C_8)$ -烯基]羰基氨基、 $[(C_2-C_8)$ 炔基]羰基氨基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]羰基氨基、 $[(C_2-C_8)$ -烯氧基]羰基氨基、 $[(C_2-C_8)$ -炔氧基]羰基氨基、 $[(C_1-C_8)$ -烷基氨基]羰基氨基、 $[(C_1-C_6)$ -烷基]羰基氧基、 $[(C_2-C_6)$ -烯基]羰基氧基、 $[(C_2-C_6)$ 炔基]羰基氧基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]羰基氧基、 $[(C_2-C_8)$ -烯氧基]羰基氧基、 $[(C_2-C_8)$ -炔氧基]羰基氧基、 (C_1-C_8) -烷基亚磺酰基及 (C_1-C_8) -烷基磺酰基,

[0096] 其中最后提及的 27 种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 NO_2 、 (C_1-C_4) -烷氧基及任选被取代的苯基的基团所取代,

[0097] 以及苯基、苯基- (C_1-C_6) -烷氧基、苯基- $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基、苯氧基、苯氧基- (C_1-C_6) -烷氧基、苯氧基- $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基、苯氧基羰基、苯基羰基氧基、以及苯氧基羰基氧基、苯基羰基氨基、苯基- $[(C_1-C_6)$ -烷基]羰基氨基、苯基- $[(C_1-C_6)$ -烷基]羰基氧基、以及苯基- $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基氧基、 (C_3-C_7) -环烷基、 (C_3-C_7) -环烷氧基、以及 (C_3-C_6) -环烷基- (C_1-C_6) -烷氧基、以及 (C_3-C_6) -环烷基- $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基、以及 (C_3-C_6) -环烷氧基- (C_1-C_6) -烷氧基、以及 (C_3-C_6) -环烷氧基- $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基、以及 (C_3-C_6) -环烷氧基羰基、以及 (C_3-C_6) -环烷基羰基氧基、以及 (C_3-C_6) -环烷氧基羰基氧基、以及 (C_3-C_6) -环烷基- $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基氧基、以及 (C_3-C_6) -环烷基羰基氨基、以及 (C_3-C_6) -环烷基- $[(C_1-C_6)$ -烷基]羰基氨基以及 (C_3-C_6) -环烷基- $[(C_1-C_6)$ -烷基]羰基氧基,

[0098] 其中最后提及的 26 种基团各自还任选与一个碳环或杂环稠合,优选与一个具有 3-6 个碳原子的碳环稠合或与一个具有 5 或 6 个环原子和 1-3 个选自 N、O 和 S 的杂原子的杂环稠合,优选苯并稠合;并且其在所述环或多环体系中为未取代的或者被一个或多个选

自卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基及硝基的基团所取代，

[0099] 以及式 $-SiR'_3$ 、 $-O-SiR'_3$ 、 $(R')_3Si-(C_1-C_6)$ -烷氧基、 $-CO-O-NR'_2$ 、 $-O-N=CR'_2$ 、 $-N=CR'_2$ 、 $-O-NR'_2$ 、 $-CH(OR')_2$ 及 $-O-(CH_2)_m-CH(OR')_2$ 的基团，

[0100] 其中基团 R' 各自彼此独立地为 H、 (C_1-C_4) -烷基或苯基，所述苯基为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基及硝基的基团所取代，或在两个相邻位置上被一个 (C_2-C_6) -亚烷基桥键所取代，并且 m 为一个 0 至 6 之间的整数，

[0101] 以及式 $R''O-CHR''-CH(OR'')-(C_1-C_6)$ -烷氧基的基团，其中基团 R'' 各自彼此独立地为 H 或 (C_1-C_4) -烷基，或者基团 R'' 一起为 (C_1-C_6) -亚烷基，并且 R'' 为 H 或 (C_1-C_4) -烷基，

[0102] 以及式 Het^1 的基团，其中 Het^1 各自彼此独立地为饱和、部分不饱和的或杂芳族的含有 3 至 9 个环原子、优选含有 5 或 6 个环原子的杂环基团，其中所述杂环基团包含选自 N、O 及 S 的 1 至 4 个杂原子、优选 1 至 3 个环杂原子；并且还任选地与一个碳环或杂环稠合，优选与一个含有 3 至 6 个碳原子的碳环或者一个含有 5 或 6 个环原子及 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子的杂环稠合，优选苯并稠合；并且在所述环或所述多环体系中为未取代的或者被一个或多个选自卤素、氰基、硫基、硝基、羟基、羧基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -卤代烯基、 (C_2-C_6) -炔基、 (C_2-C_6) -卤代炔基、 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_2-C_6) -烯氧基、 (C_2-C_6) -炔氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_6) -烷硫基、 (C_2-C_6) -烯硫基、 (C_2-C_6) -炔硫基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷氧基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_6)$ -卤代烷氧基]羰基以及氧基的基团所取代，

[0103] 或

[0104] R^1 为基于 (C_3-C_9) -环烷基、 (C_5-C_9) -环烯基、 (C_5-C_9) -环炔基或苯基的多环基团，其中基础环与一个碳环或杂环稠合，优选与一个含有 0 或 1-3 个选自 N、O 和 S 的环杂原子的 5 或 6 元环稠合，优选苯并稠合；并且其中所述基础环或所述多环体系处为未取代的或者被一个或多个选自卤素、氰基、硫基、硝基、羟基、羧基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -卤代烯基、 (C_2-C_6) -炔基、 (C_2-C_6) -卤代炔基、 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_2-C_6) -烯氧基、 (C_2-C_6) -炔氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_6) -烷硫基、 (C_2-C_6) -烯硫基、 (C_2-C_6) -炔硫基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷氧基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_6)$ -卤代烷氧基]羰基以及氧基的基团所取代，或

[0105] R^1 为一个饱和的、部分不饱和的或杂芳族的含有 3 至 9 个环原子、优选 5 或 6 个环原子的杂环基团，其包含选自 N、O 及 S 的 1 至 4 个杂原子、优选 1 至 3 个环杂原子；并且任选还与一个碳环或杂环稠合，优选与一个含有 0 或 1-3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子的 5 或 6 元环稠合，优选苯并稠合；并且在所述环或所述多环体系中为未取代的或者被一个或多个选自卤素、氰基、硫基、硝基、羟基、羧基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -卤代烯基、 (C_2-C_6) -炔基、 (C_2-C_6) -卤代炔基、 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_2-C_6) -烯氧基、 (C_2-C_6) -炔氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷氧

基-(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷硫基、(C₂-C₆)-烯硫基、(C₂-C₆)-炔基硫基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷氧基、[(C₁-C₈)-烷氧基]羰基、[(C₁-C₆)-卤代烷氧基]羰基及氧基的基团所取代。

[0106] 在此,更优选如下的化合物(I)或其盐,其中

[0107] R¹为H、(C₁-C₁₈)-烷基、(C₂-C₁₈)-烯基、(C₂-C₁₈)-炔基、(C₃-C₉)-环烷基、(C₅-C₉)-环烯基、(C₅-C₉)-环炔基或苯基,其中最后提及的7种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、氰基、硫基、硝基、羟基、以及羧基、(C₁-C₈)-烷基、(C₁-C₈)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₈)-烯基、(C₂-C₈)-卤代烯基、(C₂-C₈)-炔基、(C₂-C₈)-卤代炔基的基团所取代,最后提及的7种基团仅在为环状基础基团的情况下为(C₁-C₈)-烷氧基、(C₂-C₈)-烯氧基、(C₂-C₈)-炔氧基、(C₁-C₈)-卤代烷氧基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₈)-烷硫基、(C₂-C₈)-烯硫基、(C₂-C₈)-炔硫基,式-NR^{*}R^{**}、-CO-NR^{*}R^{**}及-O-CO-NR^{*}R^{**}的基团,

[0108] 其中最后提及的三个式子中基团R^{*}及R^{**}各自彼此独立地为H、(C₁-C₈)-烷基、(C₂-C₈)-烯基、(C₂-C₈)-炔基、苄基、被取代的苄基、苯基或被取代的苯基;或与氮原子一起为一个3至8元杂环,所述杂环除了氮原子之外,还可包含一个或两个选自N、O及S的其它环杂原子;并且其为未取代的或者被一个或多个选自(C₁-C₄)-烷基及(C₁-C₄)-卤代烷基的基团所取代,

[0109] 以及[(C₁-C₈)-烷氧基]羰基、[(C₁-C₈)-烷氧基]硫代羰基、[(C₂-C₈)-烯氧基]羰基、[(C₂-C₈)-炔氧基]羰基、[(C₁-C₈)-烷硫基]羰基、[(C₂-C₈)-烯硫基]羰基、[(C₂-C₈)-炔硫基]羰基、(C₁-C₈)-烷酰基、[(C₂-C₈)-烯基]羰基、[(C₂-C₈)-炔基]羰基、(C₁-C₄)-烷基亚氨基、(C₁-C₄)-烷氧基亚氨基、[(C₁-C₈)-烷基]羰基氨基、[(C₂-C₈)-烯基]羰基氨基、[(C₂-C₈)-炔基]羰基氨基、[(C₁-C₈)-烷氧基]羰基氨基、[(C₂-C₈)-烯氧基]羰基氨基、[(C₂-C₈)-炔氧基]羰基氨基、[(C₁-C₈)-烷基氨基]羰基氨基、[(C₁-C₆)-烷基]羰基氧基、[(C₂-C₆)-烯基]羰基氧基、[(C₂-C₆)-炔基]羰基氧基、[(C₁-C₈)-烷氧基]羰基氧基、[(C₂-C₈)-烯氧基]羰基氧基、[(C₂-C₈)-炔氧基]羰基氧基、(C₁-C₈)-烷基亚磺酰基及(C₁-C₈)-烷基磺酰基,

[0110] 其中最后提及的27种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、NO₂、(C₁-C₄)-烷氧基及任选被取代的苯基的基团所取代,

[0111] 以及苯基、苯基-(C₁-C₆)-烷氧基、苯基-[(C₁-C₆)-烷氧基]羰基、苯氧基、苯氧基-(C₁-C₆)-烷氧基、苯氧基-[(C₁-C₆)-烷氧基]羰基、苯氧基羰基、苯基羰基氧基、以及苯氧基羰基氧基、以及苯基-[(C₁-C₆)-烷氧基]羰基氧基、苯基羰基氨基、苯基-[(C₁-C₆)-烷基]羰基氨基、苯基-[(C₁-C₆)-烷基]羰基氧基、(C₃-C₇)-环烷基及(C₃-C₇)-环烷氧基、以及(C₃-C₆)-环烷氧基羰基、以及(C₃-C₆)-环烷基羰基氧基、以及(C₃-C₆)-环烷氧基羰基氧基、以及(C₃-C₆)-环烷基-[(C₁-C₆)-烷基]羰基氧基以及(C₃-C₆)-环烷基-[(C₁-C₆)-烷氧基]羰基氧基,

[0112] 其中最后提及的20种基团各自在环中为未取代的或者被一个或多个选自卤素、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基及硝基的基团所取代,

[0113] 以及式-SiR'₃、-O-SiR'₃、(R')₃Si-(C₁-C₆)-烷氧基、-CO-O-NR'₂、-O-N=CR'₂、-N=CR'₂、-O-NR'₂、-CH(OR')₂及-O-(CH₂)_m-CH(OR')₂的基团,

[0114] 其中基团 R' 各自彼此独立地为 H、(C₁-C₄)-烷基或苯基,所述苯基为未取代的或者被一个或多个选自卤素、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基及硝基的基团所取代,或在两个相邻位置处被一个 (C₂-C₆)-亚烷基桥键所取代,并且 m 为一个 0 至 6 之间的整数,

[0115] 以及式 R''O-CHR'CH(OR'')-(C₁-C₆)-烷氧基的基团,其中基团 R''各自彼此独立地为 H 或 (C₁-C₄)-烷基,或者基团 R''一起为 (C₁-C₆)-亚烷基并且 R' 为 H 或 (C₁-C₄)-烷基,

[0116] 以及式 Het¹ 的基团,其中 Het¹ 各自彼此独立地为饱和、部分不饱和的或杂芳族的含有 5 或 6 个环原子的杂环基基团,其中各个杂环基团包含 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子;并且任选还与一个碳环或杂环稠合,优选与含有 0 或 1-3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子的 5 或 6 元环稠合,优选苯并稠合;并且在所述环或多环体系中为未取代的或者被一个或多个选自卤素、羟基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷基及 (C₁-C₄)-卤代烷氧基的基团所取代。

[0117] 在此,更优选如下化合物 (I) 或其盐以及其用途,其中

[0118] R¹ 为 H、(C₁-C₁₂)-烷基、(C₂-C₁₂)-烯基、(C₂-C₁₂)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₅-C₆)-环烯基、(C₅-C₆)-环炔基或苯基,

[0119] 其中最后提及的 7 种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、氰基、硫基、硝基、羟基、(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-卤代烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₂-C₆)-卤代炔基的基团所取代,最后提及的 7 种基团仅在环状基础基团的情况下为 (C₁-C₆)-烷氧基、(C₂-C₆)-烯氧基、(C₂-C₆)-炔氧基、(C₁-C₆)-卤代烷氧基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷硫基、(C₂-C₆)-烯硫基、(C₂-C₆)-炔硫基,式 -NR^{*}R^{**}、-CO-NR^{*}R^{**}及 -O-CO-NR^{*}R^{**}的基团,

[0120] 其中最后提及的三个式子中基团 R^{*}及 R^{**}各自彼此独立地为 H、(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-炔基、苄基、苯基,所述苯基为未取代的或者被一个或多个选自卤素、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基及 (C₁-C₄)-烷氧基的基团所取代;或与氮原子一起为未取代的或者被一个或多个选自 (C₁-C₄)-烷基及 (C₁-C₄)-卤代烷基的基团所取代的哌啶、哌嗪、吡咯烷、吡唑烷、哌嗪烷 (piperazolidine) 或吗啉基团,

[0121] 以及 [(C₁-C₄)-烷氧基]羰基、[(C₁-C₄)-烷基]羰基氨基、[(C₁-C₄)-烷氧基]羰基氨基、[(C₁-C₄)-烷基]羰基氨基、[(C₁-C₄)-烷基]羰基氧基、[(C₁-C₄)-烷氧基]羰基氧基及 (C₁-C₄)-烷基磺酰基,

[0122] 其中最后提及的 7 种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、NO₂、(C₁-C₄)-烷氧基及苯基的基团所取代,所述苯基为未取代的或者被一个或多个选自卤素、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基及硝基的基团所取代,

[0123] 以及苯基、苯基-(C₁-C₄)-烷氧基、苯基-[(C₁-C₄)-烷氧基]羰基、苯氧基、苯氧基-(C₁-C₄)-烷氧基、苯氧基-[(C₁-C₄)-烷氧基]羰基、苯氧基羰基、苯基羰基氧基、苯基羰基氨基、苯基-[(C₁-C₄)-烷基]羰基氨基、苯基-[(C₁-C₄)-烷基]羰基氧基、(C₃-C₆)-环烷基及 (C₃-C₆)-环烷氧基,

[0124] 其中最后提及的 13 种基团各自在环中为未取代的或者被一个或多个选自卤素、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基及硝基的基团所取

代,

[0125] 及式 $-CO-O-NR'_2$ 、 $-O-N=CR'_2$ 、 $-N=CR'_2$ 、 $-O-NR'_2$ 、 $-CH(OR')_2$ 及 $-O-(CH_2)_m-CH(OR')_2$ 的基团,

[0126] 其中所述基团 R' 各自彼此独立地为 H、 (C_1-C_4) -烷基或苯基,所述苯基为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基及硝基的基团所取代,或者在两个相邻位置中被一个 (C_2-C_6) -亚烷基桥键所取代,并且 m 为一个 0 至 6 之间的整数,

[0127] 以及式 $R''O-CHR''-CH(OR'')-(C_1-C_6)$ -烷氧基的基团,其中所述基团 R'' 各自彼此独立地为 H 或 (C_1-C_4) -烷基或者基团 R'' 一起为一个 (C_1-C_4) -亚烷基基团,并且 R'' 为 H 或 (C_1-C_2) -烷基。

[0128] 在此,还更优选如下化合物 (I) 或其盐,其中

[0129] R^1 为 H、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -炔基或 (C_3-C_6) -环烷基,其中最后提及的 4 种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自以下的基团所取代:卤素、 (C_1-C_6) -烷基(其仅在环状基础基团的情况下为取代基)、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、未取代的或者被一个或多个选自卤素及 (C_1-C_4) -烷基所取代的 (C_3-C_6) -环烷基、以及未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基及 (C_1-C_4) -卤代烷基的基团所取代的苯基。

[0130] 在此,还特别优选如下化合物 (I) 或其盐,其中

[0131] R^1 为 H、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基或 (C_2-C_4) -炔基,其中最后提及的 3 种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、环丙基、环丁基的基团所取代,其中最后提及的两种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素和 (C_1-C_4) -烷基的基团所取代;以及未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基及 (C_1-C_4) -卤代烷氧基的基团所取代的苯基。

[0132] 在此,更优选地

[0133] R^1 还为基于 (C_3-C_9) -环烷基、 (C_5-C_9) -环烯基、 (C_5-C_9) -环炔基或苯基的多环基团,其中基础环与一个碳环或杂环稠合,优选与含有 0 或 1-3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子的 5 或 6 元环稠合,优选苯并稠合;并且其中所述基础环或所述多环体系处为未取代的或者被一个或多个选自卤素、氰基、硝基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷氧基、 $[(C_1-C_4)$ -烷氧基]羰基及 $[(C_1-C_4)$ -卤代烷氧基]羰基的基团所取代。

[0134] 还优选如下化合物 (I) 或其盐,其中

[0135] R^1 为一个饱和、部分不饱和的或杂芳族的含有 3 至 9 个环原子、优选 5 或 6 个环原子的杂环基团,其包含选自 N、O 及 S 的 1 至 4 个杂原子、优选 1 至 3 个环杂原子;并且为未取代的或者被一个或多个选自卤素、氰基、硫基、硝基、羟基、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -卤代烯基、 (C_2-C_6) -炔基、 (C_2-C_6) -卤代炔基、 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_2-C_6) -烯氧基、 (C_2-C_6) -炔氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -烷硫基、 (C_2-C_6) -烯硫基、 (C_2-C_6) -炔基硫基、 (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷氧基、 $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_6)$ -卤代烷氧基]

羰基以及氧基的基团所取代。

[0136] 还优选如下化合物 (I) 或其盐, 其中

[0137] R^1 为一个式 $SiR^aR^bR^c$ 、 $-NR^aR^b$ 或 $-N=CR^cR^d$ 的基团, 优选一个式 $-NR^aR^b$ 或 $-N=CR^cR^d$ 的基团,

[0138] 其中在最后提及的 5 个式子中基团 R^a 、 R^b 、 R^c 及 R^d 各自彼此独立地为氢、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基、苄基、被取代的苄基、苯基或被取代的苯基; 或 R^a 及 R^b 与氮原子一起为一个 3 至 8 元杂环, 所述杂环除了所述氮原子外, 还可包含一个或两个选自 N、O 及 S 的其它环杂原子, 并且其为未取代的或者被一个或多个选自 (C_1-C_4) -烷基及 (C_1-C_4) -卤代烷基的基团所取代; 或者 R^c 及 R^d 与碳原子一起为一个 3 至 8 元碳环基团或可包含 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子的杂环基团, 其中所述碳环或杂环基团处为未取代的或者被一个或多个选自 (C_1-C_4) -烷基及 (C_1-C_4) -卤代烷基的基团所取代。

[0139] 在此, 还特别优选如下化合物 (I) 或其盐, 其中

[0140] R^1 为 H、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、烯丙基、炔丙基(丙-2-炔-1-基)、丁-2-炔-1-基、丁-3-炔-1-基、2-氯代丙-2-烯-1-基、3-苯基丙-2-炔-1-基、3,3-二氯代丙-2-烯-1-基、3,3-二氯代-2-氟代丙-2-烯-1-基、甲基丙-2-炔-1-基、2-甲基丙-2-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、丁-3-烯-1-基、丁-2-炔-1-基、丁-3-炔-1-基、4-氯代丁-2-炔-1-基、3-甲基丁-2-烯-1-基、3-甲基丁-1-烯-1-基、1-(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基、(E)-戊-3-烯-2-基或(Z)-戊-3-烯-2-基,

[0141] 苯基、2-羧基苯基、2-氯代苯基、3-氯代苯基、4-氯代苯基、2-氟代苯基、3-氟代苯基、4-氟代苯基、3-甲氧基苯基、4-甲氧基苯基、2-甲氧基苯基、3-甲氧基苯基、4-甲氧基苯基、苄基、2-苯基乙基、1-苯基乙基、(4-氯代苯基)甲基[即 $CH_2(4-Cl-Ph)$]、(4-氟代苯基)甲基[即 $CH_2(4-F-Ph)$]、(4-甲氧基苯基)甲基[即 $CH_2(4-OMe-Ph)$]、2-甲氧基乙基、2,2,2-三氟代乙基、1,1,1-三氟代丙-2-基、2,2-二氟代乙基、1,3-二氟代丙-2-基、2,3-二甲氧基丙基、2,3-二甲氧基丙-2-基、2,2-二甲氧基乙-2-基、2-(2,2,2-三氟代乙氧基)乙基、2-氟代乙基、2-氯代乙基、2-溴代乙基、2-碘代乙基、2,2,3,3,3-五氟代丙基、1-羟基丙-2-基、2-羟基丙-2-基、2-羟基丙-1-基、3-羟基丙基、3-羟基丙-2-基,

[0142] (2-甲氧基乙氧基)甲基; 2-(2-甲氧基乙氧基)乙基; (2-乙氧基乙氧基)甲基; 2-(2-乙氧基乙氧基)乙基,

[0143] (乙酰氧基)甲基、(丙酰氧基)甲基、(2-甲基丙酰氧基)甲基、(2,2-二甲基丙酰氧基)甲基、1-(乙酰氧基)乙基、2-(乙酰氧基)乙基、2-(丙酰氧基)乙基、1-(丙酰氧基)乙基、1-(2-甲基丙酰氧基)乙-1-基、2-(2-甲基丙酰氧基)乙-1-基、2-(2,2-二甲基丙酰氧基)乙基[即 1-(叔丁基羰基氧基)乙基]、2-(2,2-二甲基丙酰氧基)乙基;

[0144] 1-(2,2-二甲基丙酰氧基)-2-甲基丙-1-基、1-(叔丁基羰基氧基)-2-甲基丙-1-基,

[0145] (甲氧基羰基)甲基、(乙氧基羰基)甲基、(正丙氧基羰基)甲基、(异丙氧基羰基)甲基、(正丁氧基羰基)甲基、(仲丁氧基羰基)甲基、(异丁氧基羰基)甲基、(叔丁氧基羰基)甲基、1-(甲氧基羰基)乙基、2-(甲氧基羰基)乙基、1-(乙氧基羰基)乙基、2-(乙氧基羰基)乙基、1-(正丙氧基羰基)乙基、2-(正丙氧基羰基)乙基、1-(异丙氧基羰基)乙基、2-(异丙氧基羰基)乙基、1-(正丁氧基羰基)乙基、2-(正丁氧基羰基)乙基、

1-(仲丁氧基羰基)乙基、2-(仲丁氧基羰基)乙基、1-(异丁氧基羰基)乙基、2-(异丁氧基羰基)乙基、1-(叔丁氧基羰基)乙基、2-(叔丁氧基羰基)乙基，

[0146] (甲氧基羰基氧基)甲基、(乙氧基羰基氧基)甲基、(正丙氧基羰基氧基)甲基、(异丙氧基羰基氧基)甲基、(正丁氧基羰基氧基)甲基、(仲丁氧基羰基氧基)甲基、(异丁氧基羰基氧基)甲基、(叔丁氧基羰基氧基)甲基、1-(甲氧基羰基氧基)乙基、2-(甲氧基羰基氧基)乙基、1-(乙氧基羰基氧基)乙基、2-(乙氧基羰基氧基)乙基、1-(正丙氧基羰基氧基)乙基、2-(正丙氧基羰基氧基)乙基、1-(异丙氧基羰基氧基)乙基、2-(异丙氧基羰基氧基)乙基、1-(正丁氧基羰基氧基)乙基、2-(正丁氧基羰基氧基)乙基、1-(仲丁氧基羰基氧基)乙基、2-(仲丁氧基羰基氧基)乙基、1-(异丁氧基羰基氧基)乙基、2-(异丁氧基羰基氧基)乙基、1-(叔丁氧基羰基氧基)乙基、2-(叔丁氧基羰基氧基)乙基、(环己氧基羰基氧基)甲基、1-(环己氧基羰基氧基)乙-1-基、2-(环己氧基羰基氧基)乙-1-基，

[0147] (乙酰基)甲基、1-(乙酰基)乙基、2-(乙酰基)乙基、1-(乙酰基)丙基、2-(乙酰基)-丙基、3-(乙酰基)丙基、(丙酰基)甲基、1-(丙酰基)乙基、2-(丙酰基)乙基、1-(丙酰基)丙基、2-(丙酰基)丙基、3-(丙酰基)丙基、1-(丙酰基)-2-甲基丙基，

[0148] 2-(亚乙基氨基氧基)乙基、2-(亚丙-2-基氨基氧基)乙基、2-(亚丁-2-基氨基氧基)乙基、2-(亚戊-3-基氨基氧基)乙基，

[0149] (N,N-二甲基氨基)甲基、2-(N,N-二甲基氨基)乙-1-基、1-(N,N-二甲基氨基)乙-1-基、2-(N,N-二乙基氨基)乙-1-基、1-(N,N-二乙基氨基)乙-1-基、(N,N-二乙基氨基)甲基，

[0150] (N,N-二甲基氨基羰基)甲基、1-(N,N-二甲基氨基羰基)乙基、2-(N,N-二甲基氨基羰基)乙基、(N,N-二乙基氨基羰基)甲基、1-(N,N-二乙基氨基羰基)乙基、2-(N,N-二乙基氨基羰基)乙基，

[0151] 1-(二甲基氨基)丙-2-基 [即 2-(二甲基氨基)-1-甲基乙基]、1-(二乙基氨基)丙-2-基，

[0152] 三甲代甲硅烷基甲基、1-(三甲代甲硅烷基)乙基、2-(三甲代甲硅烷基)乙基、三乙代甲硅烷基甲基、1-(三乙代甲硅烷基)乙基、2-(三乙代甲硅烷基)乙基，

[0153] 环丙基、环丙基甲基、1-环丙基乙基、2-环丙基乙基、(1-甲基环丙基)甲基、1-(1-甲基环丙基)乙基、2-(1-甲基环丙基)乙基、(2,2-二氯代环丙基)甲基、1-(2,2-二氯代环丙基)乙基、2-(2,2-二氯代环丙基)乙基、(2,2-二甲基环丙基)甲基、1-(2,2-二甲基环丙基)乙基、2-(2,2-二甲基环丙基)乙基、环丁基甲基、环戊基甲基、环己基甲基，或者

[0154] 吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、2-氯代吡啶-3-基、3-氯代吡啶-2-基，

[0155] 噁吩-2-基、噁吩-3-基、2-氯代噁吩-3-基、3-氯代噁吩-2-基、4-氯代噁吩-2-基，

[0156] (1-乙基-5-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基、1-(1-乙基-5-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基、2-(1-乙基-5-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基，

[0157] (1-乙基-3-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基、1-(1-乙基-3-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基、2-(1-乙基-3-甲基-1H-吡唑-4-基)乙基，

[0158] 四氢呋喃-2-基、四氢呋喃-3-基、四氢呋喃-2-基甲基、四氢呋喃-3-基甲基、

(5-甲基-2-氧代-1,3-间二氧杂环戊烯-4-基)甲基;

[0159] 氧杂环丁-3-基、(氧杂环丁-3-基)甲基、(氧杂环丁-2-基)甲基、(1,3-二氧戊环-2-基)甲基、(1,3-二氧戊环-4-基)甲基、5-甲基-2-氧代-1,3-二氧戊环-4-基)甲基、(吗啉-4-基)甲基;1-(吗啉-4-基)乙基、2-(吗啉-4-基)乙基、2,3-二氢-1H-茛-2-基、二氢-1H-茛-3-基、二氢-1H-茛-4-基、二氢-1H-茛-5-基,

[0160] 1H-茛-2-基、1H-茛-3-基、1H-茛-4-基、1H-茛-5-基、1H-茛-6-基或1H-茛-7-基。

[0161] 在此,还非常特别优选如下化合物(I)或其盐,其中

[0162] R^1 为H、甲基、乙基、正丙基、异丙基、苯基、苄基、(4-氯代苯基)甲基[即 $CH_2(4-Cl-Ph)$]、(4-氟代苯基)甲基[即 $CH_2(4-F-Ph)$]、(4-甲氧基苯基)甲基[即 $CH_2(4-OMe-Ph)$]、2-甲氧基乙基、四氢呋喃-2-基甲基、2-(二甲基氨基)乙基、氧杂环丁-3-基、(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基、2,2,2-三氟代乙基、2,2-二氟代乙基、2-氟代乙基、2,2,3,3,3-五氟代丙基、环丙基甲基、1-环丙基乙基、(1-甲基环丙基)甲基、(2,2-二氯代环丙基)甲基、(2,2-二甲基环丙基)甲基、烯丙基、炔丙基(丙-2-炔-1-基)、2-氯代丙-2-烯-1-基、3-苯基丙-2-炔-1-基、3,3-二氯代丙-2-烯-1-基、3,3-二氯代-2-氟代丙-2-烯-1-基、甲基丙-2-炔-1-基、2-甲基丙-2-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、丁-3-烯-1-基、丁-2-炔-1-基、丁-3-炔-1-基、4-氯代丁-2-炔-1-基、3-甲基丁-2-烯-1-基、3-甲基丁-1-烯-1-基、1-(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基、(E)-戊-3-烯-2-基或(Z)-戊-3-烯-2-基、环丁基甲基、环戊基甲基、环己基甲基或(1-乙基-5-甲基-1H-吡唑-4-基)甲基。

[0163] 还优选以下式(I)化合物或其盐,其中

[0164] R^2 为氢、卤素,或者未取代的或被一个或多个选自卤素(例如氟或氯)的基团所取代的(C_1-C_4)-烷基;优选氢或(C_1-C_4)-烷基;特别是氢、甲基或乙基;非常特别地为氢或甲基。

[0165] 还优选如下式(I)化合物或其盐,其中

[0166] R^3 为氢、卤素,或者未取代的或被一个或多个选自卤素(例如氟或氯)的基团所取代的(C_1-C_4)-烷基;优选氢或(C_1-C_4)-烷基;特别是氢或甲基;非常特别地为氢。

[0167] 还优选这样的式(I)化合物或其盐,其中 R^2 和 R^3 及与其所连接的碳原子一起为(C_3-C_6)-环烷基或(C_5-C_6)-环烯基,优选为(C_3-C_6)-环烷基,其中最后提及的3种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素及(C_1-C_4)-烷基的基团所取代。

[0168] 在此,优选地, R^2 和 R^3 及与其所连接的碳原子一起为环丙基、环丁基、环戊基或环己基,特别是环丙基,其中最后提及的4种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素和甲基——优选氟、氯和甲基——的基团所取代。

[0169] 还优选这样的式(I)化合物或其盐的用途,其中

[0170] R^4 为氢、卤素、氰基、(C_1-C_4)-烷基、(C_2-C_4)-烯基或(C_2-C_4)-炔基,

[0171] 其中最后提及的三种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素和羟基的基团所取代,优选为未取代的或者被一个或多个选自卤素(例如氟和氯)的基团所取代,或者

[0172] (C_3-C_6)-环烷基,其为未取代的或者被一个或多个选自卤素和(C_1-C_4)-烷基的基

团所取代,或者

[0173] 苯基,其为未取代的或者被一个或多个选自卤素、硝基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 $[(C_1-C_4)$ -烷氧基]羰基及 $[(C_1-C_4)$ -卤代烷氧基]羰基的基团所取代,或者

[0174] (C_1-C_4) -烷酰基,其为未取代的或者被一个或多个选自卤素(例如氟和氯)、氰基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基及 (C_1-C_2) -烷氧基- (C_1-C_2) -烷氧基的基团所取代,优选为甲酰基,或者

[0175] $[(C_1-C_4)$ -烷氧基]羰基,其为未取代的或者被一个或多个选自卤素(例如氟和氯)的基团所取代,或者

[0176] $[(C_3-C_6)$ -环烷氧基]羰基,其为未取代的或者被一个或多个选自卤素及 (C_1-C_4) -烷基的基团所取代。

[0177] 还更优选如下式(I)化合物或其盐,其中

[0178] R^4 为氢、卤素(例如氟或氯)、氰基、 (C_1-C_4) -烷基(所述 (C_1-C_4) -烷基任选地被羟基所取代[= (C_1-C_4) -羟基烷基])、 (C_1-C_4) -卤代烷基、环丙基或环丁基,其中最后提及的两种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素(例如氟和氯)以及 (C_1-C_4) -烷基的基团所取代,或者

[0179] 苯基,其为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基及 (C_1-C_4) -烷硫基的基团所取代,或者

[0180] (C_1-C_4) -烷酰基,其为未取代的或者被一个或多个选自卤素(例如氟和氯)的基团所取代,优选为甲酰基,或者

[0181] $[(C_1-C_4)$ -烷氧基]羰基或 $[(C_1-C_4)$ -卤代烷氧基]羰基,

[0182] 优选地

[0183] R^4 为氢、卤素(例如氟或氯)、氰基、甲基、乙基、正丙基、异丙基、 CH_2Cl 、 $CHCl_2$ 、 CCl_3 、 CH_2F 、 CHF_2 、 CF_3 或甲酰基。

[0184] 在此,更优选的为这样的上述优选的或特别优选的化合物(I)或其盐,其中 R^4 为氰基或其中 R^4 除了氰基或甲酰基以外还有所述其它含义之一。

[0185] 更优选地, R^4 为除氢以外的所述用于 R^4 的基团之一。

[0186] 更优选地, R^4 为氢。

[0187] 还优选如下式(I)化合物或其盐,其中

[0188] R^5 为苯基,其为未取代的或取代的,并且包括取代基在内含有6至24个碳原子、特别是6至20个碳原子,或者

[0189] 一个含有1至3个选自N、O及S的环杂原子的5或6元杂芳族基团,并且其为未取代的或取代的,并且包括取代基在内含有1至24个碳原子、特别是1至20个碳原子。

[0190] 此外优选地,

[0191] R^5 为一个苯基基团或一个含有1至3个选自N、O及S的环杂原子的5或6元杂芳族基团,其中所述苯基基团或所述杂环基团为未取代的或者被一个或多个选自以下的基团所取代:

[0192] (a) 卤素、羟基、氨基、硝基、羧基、氰基及氨基甲酰基,

[0193] (b) (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -炔基、 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_1-C_6) -烯氧基以及 (C_1-C_6) -炔氧基,其中最后提及的 6 种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、单及二 [(C_1-C_4) -烷基]氨基、羟基、羧基、 $[(C_1-C_4)$ -烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_4)$ -卤代烷氧基]羰基、单及二 [(C_1-C_4) -烷基]氨基羰基以及氰基的基团所取代,

[0194] (c) (C_1-C_6) -烷硫基、 $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_6)$ -卤代烷氧基]羰基、 (C_1-C_6) -烷酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷酰基、单及二 [(C_1-C_4) -烷基]氨基羰基、单及二 [(C_1-C_6) -酰基]氨基、单及二 [(C_1-C_4) -烷基]氨基、N- $[(C_1-C_6)$ -酰基]-N- $[(C_1-C_6)$ -烷基]氨基、 (C_1-C_6) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_6) -烷基亚磺酰基氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷基亚磺酰基氧基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷基磺酰基氧基、 (C_1-C_6) -烷基硫酸根合(sulfato)、 (C_1-C_6) -卤代烷基硫酸根合,以及

[0195] (d) (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基氧基、苯基以及苯氧基,其中最后提及的 4 种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基以及 (C_1-C_4) -烷硫基的基团所取代,

[0196] 并且其中两个相邻的取代基可形成一个稠合的 5 或 6 元环,其为碳环或可包含另外 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子,并且其为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基以及 (C_1-C_4) -烷硫基的基团所取代。

[0197] 此外优选地,

[0198] R^5 为苯基,

[0199] 其为未取代的或者被一个或多个选自以下基团的基团所取代:

[0200] (a) 卤素、羟基、氨基、硝基、羧基、氰基以及氨基甲酰基,

[0201] (b) (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -炔基和 (C_1-C_6) -烷氧基,其中最后提及的 4 种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、羟基、羧基、 $[(C_1-C_4)$ -烷氧基]羰基及氰基的基团所取代,

[0202] (c) (C_1-C_6) -烷硫基、 $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_6)$ -卤代烷氧基]羰基、 (C_1-C_6) -烷酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷酰基、单及二 [(C_1-C_4) -烷基]氨基羰基、单及二 [(C_1-C_6) -酰基]氨基、单及二 [(C_1-C_4) -烷基]氨基、N- $[(C_1-C_6)$ -酰基]-N- $[(C_1-C_6)$ -烷基]氨基、 (C_1-C_6) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_6) -烷基亚磺酰基氧基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰基氧基以及 (C_1-C_6) -卤代烷基磺酰基氧基,以及

[0203] (d) (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基氧基、苯基以及苯氧基,

[0204] 其中最后提及的 4 种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基以及 (C_1-C_4) -烷硫基的基团所取代,

[0205] 并且其中两个相邻的取代基可形成一个稠合的 5 或 6 元环,其为碳环或可包含另外 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子,并且为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基以及 (C_1-C_4) -烷

巯基的基团所取代，

[0206] 或者

[0207] R^5 为一个含有 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子的 5 或 6 元杂芳族基团，其为未取代的或者被一个或多个选自以下的基团所取代：

[0208] (a) 卤素、羟基、氨基、硝基、羧基、氰基以及氨基甲酰基，

[0209] (b) (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -炔基及 (C_1-C_6) -烷氧基，其中最后提及的 6 种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、单及二 [(C_1-C_4) -烷基] 氨基、羟基、羧基、 $[(C_1-C_4)$ -烷氧基] 羰基及氰基的基团所取代，

[0210] (c) (C_1-C_6) -烷硫基、 $[(C_1-C_6)$ -烷氧基] 羰基、 $[(C_1-C_6)$ -卤代烷氧基] 羰基、 (C_1-C_6) -烷酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷酰基、单及二 [(C_1-C_4) -烷基] 氨基羰基、单及二 [(C_1-C_6) -酰基] 氨基、单及二 [(C_1-C_4) -烷基] 氨基、N- $[(C_1-C_6)$ -酰基]-N- $[(C_1-C_6)$ -烷基] 氨基、 (C_1-C_6) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷基磺酰基、 (C_1-C_6) -烷基亚磺酰基氧基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰基氧基以及 (C_1-C_6) -卤代烷基磺酰基氧基，以及

[0211] (d) (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷氧基、苯基以及苯氧基，

[0212] 其中最后提及的 4 种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基以及 (C_1-C_4) -烷硫基的基团所取代，

[0213] 并且其中两个相邻的取代基可形成一个稠合的 5 或 6 元环，其为碳环或可包含另外 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子，并且为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -卤代烷氧基以及 (C_1-C_4) -烷硫基的基团所取代。

[0214] 更优选使用如下的式 (I) 化合物或其盐，其中

[0215] R^5 为苯基

[0216] 其为未取代的或者优选被一个或多个选自以下的基团取代：卤素、羟基、氨基、硝基、羧基、氰基、氨基甲酰基、 (C_1-C_6) -烷基、以及 (C_2-C_4) -烯基、以及 (C_2-C_4) -炔基、 (C_1-C_6) -卤代烷基、 (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、单及二 [(C_1-C_4) -烷基] 氨基- (C_1-C_4) -烷基、羟基- (C_1-C_4) -烷基、羧基- (C_1-C_4) -烷基、氰基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基（其还可任选地被卤化，其 [= (C_1-C_6) -卤代烷氧基]）、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_6) -烷硫基、 $[(C_1-C_6)$ -烷氧基] 羰基、 $[(C_1-C_6)$ -卤代烷氧基] 羰基、 (C_1-C_6) -烷酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷酰基、单及二 [(C_1-C_4) -烷基] 氨基羰基、单及二 [(C_1-C_6) -酰基] 氨基、单及二 [(C_1-C_4) -烷基] 氨基、N- $[(C_1-C_6)$ -酰基]-N- $[(C_1-C_6)$ -烷基] 氨基、 (C_1-C_6) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_6) -烷基磺酰基、 (C_1-C_6) -卤代烷基磺酰基、以及 (C_1-C_4) -烷基磺酰基氧基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基氧基、苯基及苯氧基，

[0217] 其中最后提及的四种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、 (C_1-C_4) -烷基及 (C_1-C_4) -卤代烷基的基团所取代，

[0218] 并且其中两个相邻的取代基可形成一个稠合的 5 或 6 元环，其为碳环或可包含另

外 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子,并且其为未取代的或者被一个或多个选自卤素及 (C₁-C₆)-烷基的基团所取代,

[0219] 或者

[0220] R⁵ 为一个含有 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子的 5 或 6 元杂芳族基团

[0221] 其为未取代的或者被一个或多个选自以下的基团所取代:卤素、羟基、氨基、硝基、羧基、氰基、氨基甲酰基、(C₁-C₆)-烷基、以及 (C₂-C₄)-烯基、以及 (C₂-C₄)-炔基、(C₁-C₆)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷硫基-(C₁-C₄)-烷基、单及二 [(C₁-C₄)-烷基]氨基-(C₁-C₄)-烷基、羟基-(C₁-C₄)-烷基、羧基-(C₁-C₄)-烷基、氰基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基(其还可被任选地卤代,其 [= (C₁-C₆)-卤代烷氧基])、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷硫基、[(C₁-C₆)-烷氧基]羰基、[(C₁-C₆)-卤代烷氧基]羰基、(C₁-C₆)-烷酰基、(C₁-C₆)-卤代烷酰基、单及二 [(C₁-C₄)-烷基]氨基羰基、单及二 [(C₁-C₆)-酰基]氨基、单及二 [(C₁-C₄)-烷基]氨基、N-[(C₁-C₆)-酰基]-N-[(C₁-C₆)-烷基]氨基、(C₁-C₆)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₆)-烷基磺酰基、(C₁-C₆)-卤代烷基磺酰基、以及 (C₁-C₄)-烷基磺酰基氧基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基氧基、苯基及苯氧基,

[0222] 其中最后提及的 4 种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、(C₁-C₄)-烷基及 (C₁-C₄)-卤代烷基的基团所取代,

[0223] 并且其中两个相邻的取代基可形成一个稠合的 5 或 6 元环,其为碳环或可包含另外 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子,并且为未取代的或者被一个或多个选自卤素及 (C₁-C₆)-烷基的基团所取代。

[0224] 在此,还更优选如下的式 (I) 化合物或其盐,其中

[0225] R⁵ 为苯基,其为未取代的或者优选地被一个或多个选自以下的基团所取代:卤素、羟基、硝基、羧基、氰基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷硫基-(C₁-C₄)-烷基、羟基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基(其还可任选地被卤代,其 [= (C₁-C₄)-卤代烷氧基])、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-烷硫基、[(C₁-C₄)-烷氧基]羰基、[(C₁-C₆)-卤代烷氧基]羰基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基磺酰基、(C₃-C₆) 环烷基、(C₃-C₆) 环烷基氧基、苯基及苯氧基,

[0226] 其中最后提及的 4 种基团各自为未取代的或者被一个或多个选自卤素、(C₁-C₄)-烷基及 (C₁-C₄)-卤代烷基的基团所取代,

[0227] 并且其中两个相邻的取代基可形成一个稠合的 5 或 6 元环,其为碳环或可包含另外 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子,并且为未取代的或者被一个或多个选自卤素及 (C₁-C₄)-烷基的基团所取代,

[0228] 或者

[0229] R⁵ 为一个含有 1 至 3 个选自 N、O 及 S 的环杂原子的 5 或 6 元杂芳族基团

[0230] 其为未取代的或者被一个或多个选自以下的基团取代:卤素、羟基、羧基、氰基、以及氨基、(C₁-C₄)-烷基、以及 (C₂-C₄)-烯基、以及 (C₂-C₄)-炔基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷硫基-(C₁-C₄)-烷基、羟基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基(其还可被任选地卤代,其 [= (C₁-C₄)-卤代烷氧基])、(C₁-C₄)-烷氧

基-(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-烷硫基、[(C₁-C₆)-烷氧基]羰基、[(C₁-C₆)-卤代烷氧基]羰基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基、(C₁-C₄)-卤代烷基磺酰基、以及(C₁-C₄)-烷基磺酰基氧基、以及单及二[(C₁-C₄)-烷基]氨基；以及苯基和(C₃-C₆)-环烷基的基团所取代，所述(C₃-C₆)-环烷基为未取代的或者被一个或多个选自卤素、(C₁-C₄)-烷基及(C₁-C₄)-卤代烷基的基团所取代，

[0231] 并且其中两个相邻的取代基可形成一个稠合的5或6元环，其为碳环或可包含另外1至3个选自N、O及S的环杂原子，并且为未取代的或者被一个或多个选自卤素及(C₁-C₄)-烷基的基团所取代。

[0232] 在此，还甚至更优选如下的式(I)化合物或其盐，其中

[0233] R⁵ 为苯基，其为未取代的或者优选被一个或多个选自卤素、氰基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基及(C₁-C₄)-烷硫基的基团所取代，并且任选地被苯并稠合，

[0234] 或者

[0235] R⁵ 为一个含有1至3个选自N、O及S的环杂原子的5或6元杂芳族基团，

[0236] 其为未取代的或者被一个或多个选自卤素、羟基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基及(C₁-C₄)-烷硫基以及(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、苯基、氨基、单及二[(C₁-C₄)-烷基]氨基及(C₁-C₄)-烷基磺酰基氧基的基团所取代，并且任选地被苯并稠合。

[0237] 特别优选如下的式(I)化合物或其盐，其中

[0238] R⁵ 为苯基，其为未取代的或者优选地被一个或多个选自卤素（例如氟、氯、溴和碘）、氰基、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、甲氧基及乙氧基的基团所取代，并且任选地被稠合，

[0239] 优选地

[0240] R⁵ 为苯基、2-氟代苯基、2-氯代苯基、2-溴代苯基、2-碘代苯基、2-甲基苯基、4-(叔丁基)苯基、2-三氟代甲基苯基、2-甲氧基苯基或2-氰基苯基或2-硝基苯基或4-硝基苯基、3-氟代苯基、3-氯代苯基、3-溴代苯基、3-碘代苯基、3-甲基苯基、3-三氟代甲基苯基、3-甲氧基苯基、4-羧基苯基、4-氟代苯基、4-氯代苯基、4-溴代苯基、4-碘代苯基、4-甲基苯基、4-三氟代甲基苯基、4-甲氧基苯基、2,3-二氯代苯基、2,3-二甲基苯基、2,4-二氯代苯基、2,4-二甲基苯基、2,5-二氯代苯基、2,5-二甲基苯基、2,6-二氯代苯基或2,4-二氟代苯基、2,6-二甲基苯基、3,4-二氯代苯基或3,4-二氟代苯基、3,4-二甲基苯基、3,5-二氯代苯基、3,5-二甲基苯基、2-氯代-3-甲基苯基、2-氯代-4-甲基苯基、2-氯代-5-甲基苯基、2-氯代-6-甲基苯基、3-氯代-4-甲基苯基、3-氯代-5-甲基苯基、3-氯代-2-甲基苯基、4-氯代-2-甲基苯基、4-氯代-3-甲基苯基或5-氯代-2-甲基苯基、4-苯基苯基、3-三氟代甲基-4-氯代苯基、4-苯氧基-苯基、4-羧基甲基苯基、4-乙酰基苯基(=4-甲基羰基苯基)或1,3-苯并间二氧杂环戊烯-5-基。

[0241] 在此，还优选如下的式(I)化合物或其盐，其中

[0242] R⁵ 为2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、2-噁吩基、3-噁吩基、2-呋喃基、3-呋喃基、2-吡咯基、3-吡咯基、2-咪唑基、4-咪唑基、5-咪唑基、3-哒嗪基、4-哒嗪基、2-吡嗪基、3-吡嗪基、2-咪唑啉基、4-咪唑啉基、1-吡唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、1,3-

5-三嗪-2-基、1,2,4-三嗪-3-基、1,2,4-三嗪-5-基、2-噻唑基、1,3-苯并噻唑-2-基、4-噻唑基、5-噻唑基、3-异噻唑基、4-异噻唑基、5-异噻唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、3-异噁唑基、4-异噁唑基、5-异噁唑基、噻二唑基或三唑基,或3-异喹啉基、2-喹啉基、1,3-苯并噻唑-2-基或1,3-苯并噁唑-2-基;优选地2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、2-嘧啶基、2-吡嗪基、2-噻吩基、3-噻吩基、2-呋喃基或2-噻唑基,或3-异喹啉基或2-喹啉基;其中上述杂芳族基团各自为未取代的或取代的,优选地被上述优选的基团所取代,特别是被一个或多个选自卤素、羟基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基及 (C_1-C_4) -烷硫基以及 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_1-C_4) -烷基氨基、二- $[(C_1-C_4)$ -烷基]氨基及 (C_1-C_4) -烷基磺酰基氧基的基团所取代。

[0243] 在此,特别优选的还有这样的式(I)化合物或其盐,其中

[0244] R^5 为2-吡啶基、3-氟代吡啶-2-基、3-氯代吡啶-2-基、3-溴代吡啶-2-基、3-甲基吡啶-2-基、3-甲氧基吡啶-2-基、3-三氟代甲基吡啶-2-基、4-氟代吡啶-2-基、4-氯代吡啶-2-基、4-溴代吡啶-2-基、4-甲基吡啶-2-基、4-甲氧基吡啶-2-基、4-三氟代甲基吡啶-2-基、5-氟代吡啶-2-基、5-氯代吡啶-2-基、5-溴代吡啶-2-基、5-甲基吡啶-2-基、5-甲氧基吡啶-2-基、5-三氟代甲基吡啶-2-基、6-氟代吡啶-2-基、6-氯代吡啶-2-基、6-溴代吡啶-2-基、6-甲基吡啶-2-基、6-甲氧基吡啶-2-基、6-三氟代甲基吡啶-2-基、4,6-二甲基吡啶-2-基,

[0245] 3-吡啶基、2-氟代吡啶-3-基、2-氯代吡啶-3-基、2-溴代吡啶-3-基、2-甲基吡啶-3-基、2-甲氧基吡啶-3-基、2-三氟代甲基吡啶-3-基、4-氟代吡啶-3-基、4-氯代吡啶-3-基、4-溴代吡啶-3-基、4-甲基吡啶-3-基、4-甲氧基吡啶-3-基、4-三氟代甲基吡啶-3-基、5-氟代吡啶-3-基、5-氯代吡啶-3-基、5-溴代吡啶-3-基、5-甲基吡啶-3-基、5-甲氧基吡啶-3-基、5-三氟代甲基吡啶-3-基、6-氟代吡啶-3-基、6-氯代吡啶-3-基、6-溴代吡啶-3-基、6-甲基吡啶-3-基、6-甲氧基吡啶-3-基、6-三氟代甲基吡啶-3-基、6-羟基吡啶-3-基,

[0246] 4-吡啶基、2-氟代吡啶-4-基、2-氯代吡啶-4-基、2-溴代吡啶-4-基、2-甲基吡啶-4-基、2-甲氧基吡啶-4-基、2-三氟代甲基吡啶-4-基、3-氟代吡啶-4-基、3-氯代吡啶-4-基、3-溴代吡啶-4-基、3-甲基吡啶-3-基、3-甲氧基吡啶-4-基、3-三氟代甲基吡啶-4-基或5-碘代吡啶-2-基、5-二甲基氨基吡啶-2-基、5-甲基氨基吡啶-2-基、5-甲硫基吡啶-2-基、5-甲氧基吡啶-2-基、5-二氟代甲氧基吡啶-2-基、5-羟基吡啶-2-基、5-乙炔基吡啶-2-基、5-环丙基吡啶-2-基、5-烯丙基吡啶-2-基、5-苯基吡啶-2-基、5-氨基吡啶-2-基或5-甲基磺酰氧基吡啶-2-基,

[0247] 2-噻吩基、3-氟代噻吩-2-基、3-氯代噻吩-2-基、3-溴代噻吩-2-基、3-甲基噻吩-2-基、3-甲氧基噻吩-2-基、3-三氟代甲基噻吩-2-基、4-氟代噻吩-2-基、4-氯代噻吩-2-基、4-溴代噻吩-2-基、4-甲基噻吩-2-基、4-甲氧基噻吩-2-基、4-三氟代甲基噻吩-2-基、5-氟代噻吩-2-基、5-氯代噻吩-2-基、5-溴代噻吩-2-基、5-碘代-2-噻吩基、5-甲基噻吩-2-基、5-甲氧基噻吩-2-基、5-三氟代甲基噻吩-2-基或5-烯丙基吡啶-2-基、5-乙炔基吡啶-2-基、5-(甲基磺酰氧基)吡啶-2-基或5-甲硫基吡啶-2-基,

[0248] 3-噻吩基、2-氟代噻吩-3-基、2-氯代噻吩-3-基、2-溴代噻吩-3-基、2-甲基噻吩-3-基、2-甲氧基噻吩-3-基、2-三氟代甲基噻吩-3-基、4-氟代噻吩-3-基、4-氯代噻

吩-3-基、4-溴代噻吩-3-基、4-甲基噻吩-3-基、4-甲氧基噻吩-3-基、4-三氟代甲基噻吩-3-基、5-氟代噻吩-3-基、5-氯代噻吩-3-基、5-溴代噻吩-3-基、5-甲基噻吩-3-基、5-甲氧基噻吩-3-基、5-三氟代甲基噻吩-3-基,或

[0249] 2-呋喃基、3-氟代呋喃-2-基、3-氯代呋喃-2-基、3-溴代呋喃-2-基、3-甲基呋喃-2-基、3-甲氧基呋喃-2-基、3-三氟代甲基呋喃-2-基、4-氟代呋喃-2-基、4-氯代呋喃-2-基、4-溴代呋喃-2-基、4-甲基呋喃-2-基、4-甲氧基呋喃-2-基、4-三氟代甲基呋喃-2-基、5-氟代呋喃-2-基、5-氯代呋喃-2-基、5-溴代呋喃-2-基、5-甲基呋喃-2-基、5-甲氧基呋喃-2-基或5-三氟代甲基呋喃-2-基,

[0250] 2-噻唑基、4-甲基-噻唑-2-基、5-甲基噻唑-2-基、5-溴代噻唑-2-基、5-氯代噻唑-2-基、4,5-二甲基噻唑-2-基、4,5-二氯代噻唑-2-基、1,3-苯并噻唑-2-基、7-氯代-1,3-苯并噻唑-2-基或2-溴代噻唑-4-基、2-氯代噻唑-4-基、4-噻唑基、6-氯代-1,3-苯并噻唑-2-基、7-溴代-1,3-苯并噻唑-2-基、6-溴代-1,3-苯并噻唑-2-基、1,3-苯并噻唑-2-基、7-氯代-1,3-苯并噻唑-2-基、6-氯代-1,3-苯并噻唑-2-基、7-溴代-1,3-苯并噻唑-2-基、6-溴代-1,3-苯并噻唑-2-基,

[0251] 2-吡嗪基、5-甲基吡嗪基-2-基,

[0252] 1,5-二甲基吡啶-3-基或1-甲基吡啶-3-基或1-甲基吡啶-5-基,

[0253] 2-嘧啶基、5-氟代嘧啶-2-基、5-氯代嘧啶-2-基、5-溴代嘧啶-2-基、或5-碘代嘧啶-2-基或5-甲基嘧啶-2-基、4,6-二甲基嘧啶-2-基,

[0254] 3-哒嗪基、6-甲基哒嗪-3-基,

[0255] 1,2,4-三嗪-3-基或6-甲基-1,2,4-三嗪-3-基或3-异喹啉基或2-喹啉基,

[0256] 优选地

[0257] R^5 为2-吡啶基、5-氟代吡啶-2-基、5-氯代吡啶-2-基、5-溴代吡啶-2-基、5-甲基吡啶-2-基、5-甲氧基吡啶-2-基、5-三氟代甲基吡啶-2-基、3-吡啶基、6-氟代吡啶-3-基、6-氯代吡啶-3-基、6-溴代吡啶-3-基、6-甲基吡啶-3-基、6-甲氧基吡啶-3-基或6-三氟代甲基吡啶-3-基、4,6-二甲基吡啶-2-基、2-噻吩基、3-氯代噻吩-2-基、3-甲基噻吩-2-基、4-氯代噻吩-2-基、4-甲基噻吩-2-基、5-氯代噻吩-2-基、5-溴代噻吩-2-基、5-碘代-2-噻吩基、5-甲基噻吩-2-基、2-噻唑基、5-溴代噻唑-2-基、5-氯代噻唑-2-基、4,5-二甲基噻唑-2-基、4,5-二氯代噻唑-2-基、1,3-苯并噻唑-2-基、2-吡嗪基、5-甲基吡嗪-2-基、1,5-二甲基吡啶-3-基、2-嘧啶基、5-溴代嘧啶-2-基、5-甲基嘧啶-2-基、4,6-二甲基嘧啶-2-基、3-哒嗪基或6-甲基哒嗪-3-基、4-氟代吡啶-2-基、4-氯代吡啶-2-基、4-溴代吡啶-2-基、4-甲基吡啶-2-基或4-三氟代吡啶-2-基或3-异喹啉基或2-喹啉基。

[0258] 还优选如下式(I)化合物或其盐,其中

[0259] $(R^6)_n$ 为n个取代基 R^6 ,其中 R^6 ——若 $n=1$ ——为或各个取代基 R^6 彼此独立地——若n大于1——为卤素、氰基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -卤代烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基或 (C_1-C_4) -卤代烷基磺酰基,并且

[0260] n为0、1、2或3,优选0、1或2。

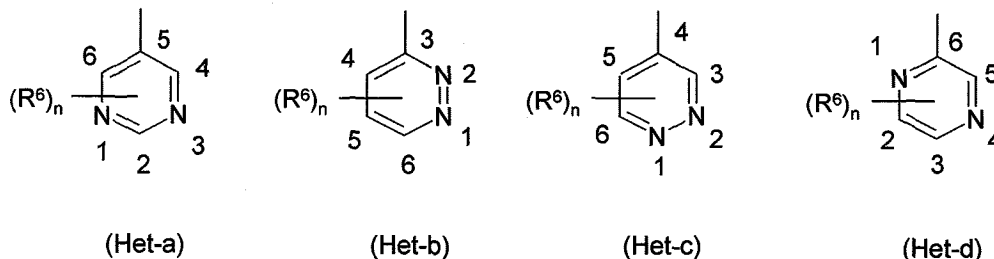
[0261] 在此,还优选如下的式(I)化合物或其盐,其中

[0262] $(R^6)_n$ 为 n 个取代基 R^6 , 其中 R^6 ——若 $n = 1$ ——为或各个取代基 R^6 彼此独立地——若 n 大于 1——为卤素 (例如氟、氯、溴或碘)、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、甲基磺酰基或乙基磺酰基, 并且

[0263] n 为 0、1、2 或 3, 优选 0、1 或 2。

[0264] 优选这样的式 (I) 化合物或其盐, 其中 Het 为式 (Het-a)、(Het-b)、(Het-c) 或 (Het-d) 的基团

[0265]



[0266] 其中 $(R^6)_n$ 具有上述提及的或上述优选的含义。

[0267] 更优选如下式 (I) 化合物或其盐, 其中

[0268] Het 为这样的所述基团 (Het-a), 其中

[0269] n 为 0 (= 数字零, 即不存在取代基 R^6 , 即环上的所有自由键均被氢占据) 或

[0270] $(R^6)_n$ 为 2- 氟、2- 氯、2- 氰基、2- 甲基、2- 乙基、2- CF_3 、2- 甲氧基、2- 乙氧基、2- 甲硫基、2- 甲基亚磺酰基、2- 甲基磺酰基、4- 氟、4- 氯、4- 溴、4- 氰基、4- 甲基、4- 乙基、4- CF_3 、4- 甲氧基、4- 乙氧基、4- 甲硫基、4- 甲基亚磺酰基、4- 甲基磺酰基、2, 4- 二甲基、2, 4- 二氟、2, 4- 二氯、4, 6- 二甲基、4, 6- 二氟或 4, 6- 二氯,

[0271] 其中基团的编号指所述基团在嘧啶 -5- 基基团上的位置, 在所述嘧啶 -5- 基中氮环原子位于该环的 1- 及 3- 位。

[0272] 在此, 特别优选如下式 (I) 化合物或其盐, 其中

[0273] Het 为这样的所述基团 (Het-a), 其中 $n = 0$ 或

[0274] $(R^6)_n$ 为 4- 氟、4- 氯、4- 甲基、4- 三氟代甲基、4- 甲氧基、4- 甲基磺酰基、4- 甲基亚磺酰基或 4- 甲硫基, 优选 4- 甲基。

[0275] 更优选如下式 (I) 化合物或其盐, 其中

[0276] Het 为这样的所述基团 (Het-b)

[0277] 其中

[0278] n 为 0 (= 数字零, 即不存在取代基 R^6 , 即环上的所有自由键均被氢占据) 或

[0279] $(R^6)_n$ 为 4- 氟、4- 氯、4- 溴、4- 氰基、4- 甲基、4- 乙基、4- 三氟代甲基、4- 甲氧基、4- 乙氧基、4- 甲硫基、4- 甲基亚磺酰基、4- 甲基磺酰基、6- 氯、6- 氟、6- 氰基、6- 甲基、6- 乙基、6- 三氟代甲基、6- 甲氧基、6- 乙氧基、6- 甲硫基、6- 甲基亚磺酰基、6- 甲基磺酰基、4, 6- 二甲基、4, 6- 二氟或 4, 6- 二氯,

[0280] 其中基团的编号指所述基团在哒嗪 -3- 基基团上的位置, 在所述哒嗪 -3- 基上氮环原子位于该环的 1- 及 2- 位。

[0281] 在此, 特别优选如下式 (I) 化合物或其盐, 其中

[0282] Het 为这样的所述基团 (Het-b), 其中 $n = 0$, 或

[0283] $(R^6)_n$ 为 4- 氟、4- 氯、4- 甲基、4- 三氟代甲基、4- 甲氧基、4- 甲基磺酰基、4- 甲基亚磺酰基或 4- 甲硫基, 优选 4- 甲基。

[0284] 更优选如下式 (I) 化合物或其盐, 其中

[0285] Het 为这样的所述基团 (Het-c), 其中

[0286] n 为 0 (= 数字零, 即不存在取代基 R^6 , 即环上的所有自由键均被氢占据) 或

[0287] $(R^6)_n$ 为 5- 氟、5- 氯、5- 溴、5- 氰基、5- 甲基、5- 乙基、5- 三氟代甲基、5- 甲氧基、5- 乙氧基、5- 甲硫基、5- 甲基亚磺酰基、5- 甲基磺酰基、3, 5- 二甲基、3, 5- 二氟或 3, 5- 二氯,

[0288] 其中基团的编号指所述基团在 4- 吡嗪基上的位置, 在所述 4- 吡嗪基上氮环原子位于该环的 1- 及 2- 位。

[0289] 在此, 特别优选如下式 (I) 化合物或其盐, 其中

[0290] Het 为这样的所述基团 (Het-c), 其中 $n = 0$; 或其中

[0291] $(R^6)_n$ 为 5- 氟、5- 氯、5- 甲基、5- 三氟代甲基、5- 甲氧基、5- 甲基磺酰基、5- 甲基亚磺酰基或 5- 甲硫基, 优选 5- 甲基。

[0292] 更优选如下式 (I) 化合物或其盐, 其中

[0293] Het 为这样的所述基团 (Het-d), 其中

[0294] n 为 0 (= 数字零, 即不存在取代基 R^6 , 即环上的所有自由键均被氢占据) 或

[0295] $(R^6)_n$ 为 3- 氯、3- 氟、3- 氰基、3- 甲基、3- 乙基、3- CF_3 、3- 甲氧基、3- 乙氧基、3- 甲硫基、3- 甲基亚磺酰基、3- 甲基磺酰基、5- 氟、5- 氯、5- 溴、5- 氰基、5- 甲基、5- 乙基、5- CF_3 、5- 甲氧基、5- 乙氧基、5- 甲硫基、5- 甲基亚磺酰基、5- 甲基磺酰基、3, 5- 二甲基、3, 5- 二氟、3, 5- 二氯,

[0296] 其中基团的编号指所述基团在 6- 吡嗪基上的位置, 在所述 6- 吡嗪基上氮环原子位于该环的 1- 及 4- 位。

[0297] 在此, 特别优选如下式 (I) 化合物或其盐, 其中

[0298] Het 为这样的所述基团 (Het-d), 其中 $n = 0$, 或其中

[0299] $(R^6)_n$ 为 5- 氟、5- 氯、5- 甲基、5- 三氟代甲基、5- 甲氧基、5- 甲基磺酰基、5- 甲基亚磺酰基或 5- 甲硫基, 优选 5- 甲基。

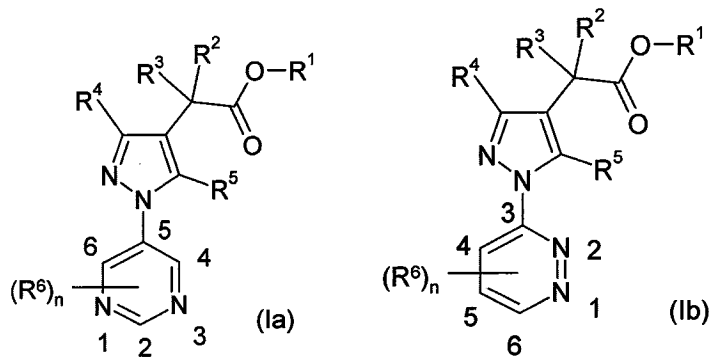
[0300] 还优选如下式 (I) 化合物或其盐, 其中

[0301] Het 为所述基团 (Het-a)、(Het-b)、(Het-c) 或 (Het-d), 其中 n 各自 = 0。

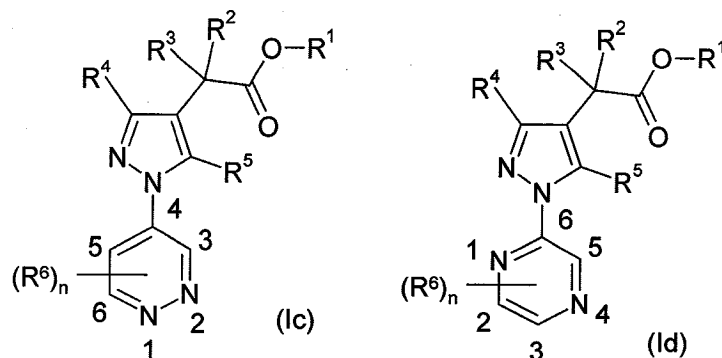
[0302] 还优选如下的式 (I) 化合物或其盐, 其中所述基团 Het、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 以及 n 是根据所述优选含义中的两个或多个所选择的。

[0303] 优选的式 (I) 化合物或其盐为式 (Ia)、(Ib)、(Ic) 及 (Id) 的化合物及其盐,

[0304]



[0305]



[0306] 其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 n 如式 (I) 中定义或根据所述优选含义定义。

[0307] 特别优选的为这样的通式 (Ia) 的化合物或其盐, 其中

[0308] R^1 为氢并且 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 n 如式 (I) 中的定义 [=式 (Ia'') 化合物] 或

[0309] R^1 为甲基并且 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 n 如式 (I) 中的定义 [=式 (Ia''') 的化合物] 或

[0310] R^2 和 R^3 各自为氢, 并且 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 n 如式 (I) 中的定义 [=式 (Ia'''') 的化合物]。

[0311] 特别优选的还有这样的通式 (Ib) 的化合物或其盐, 其中

[0312] R^1 为氢并且 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 n 如式 (I) 中的定义 [=式 (Ib'') 的化合物] 或

[0313] R^1 为甲基并且 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 n 如式 (I) 中的定义 [=式 (Ib''') 的化合物] 或

[0314] R^2 和 R^3 各自为氢, 并且 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 n 如式 (I) 中的定义 [=式 (Ib'''') 的化合物]。

[0315] 特别优选如下的通式 (Ic) 化合物或其盐, 其中

[0316] R^1 为氢并且 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 n 如式 (I) 中的定义 [=式 (Ic'') 的化合物] 或

[0317] R^1 为甲基并且 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 n 如式 (I) 中的定义 [=式 (Ic''') 的化合物] 或

[0318] R^2 和 R^3 各自为氢, 并且 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 n 如式 (I) 中的定义 [=式 (Ic'''') 的化合物]。

[0319] 特别优选如下的通式 (Id) 的化合物或其盐, 其中

[0320] R^1 为氢并且 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 n 如式 (I) 中的定义 [=式 (Id'') 的化合物] 或

[0321] R^1 为甲基并且 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 n 如式 (I) 中的定义 [=式 (Id'") 的化合物] 或

[0322] R^2 和 R^3 各自为氢, 并且 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 n 如式 (I) 中的定义 [=式 (Id'") 的化合物]。

[0323] 在此, 特别优选这样的式 (I)、(Ia)、(Ib)、(Ic) 及 (Id) 的化合物及其盐, 其中所述基团 R^1 至 R^6 中的一个或多个具有实例表中所用的基团含义。

[0324] 在此, 特别优选这样的式 (I) 化合物及其盐, 其中所述基团 R^1 至 R^6 中的一个或多个具有实例表中所用的基团含义。

[0325] 本发明的式 (I) 化合物包括所有可基于分子上的不对称中心或双键存在的立体异构体——这些分子的构型在式子中没有具体指定或其没有明确指出——及其混合物, 包括外消旋化合物和部分富集特定立体异构体的混合物。

[0326] 本发明还包括所有互变异构体 (例如酮和烯醇互变异构体) 及其混合物和盐, 如果合适存在官能团。

[0327] 本发明还提供制备通式 (I) 化合物和 / 或其盐的方法。

[0328] 本发明的式 (I) 化合物可通过多种备选方法制备。

[0329] 在以下方法中, 在一些情况下使用溶剂。本文中, “惰性溶剂”是指各自在特定反应条件下呈惰性的、但不必在任何反应条件下均呈惰性的溶剂。

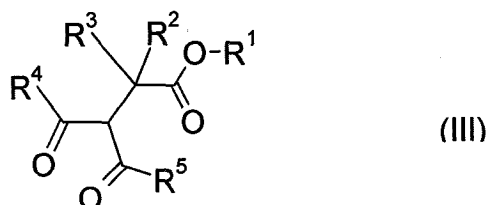
[0330] (a) 为制备通式 (I) 的化合物或其盐, 其中 Het、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 具有上述式 (I) 中的含义,

[0331] 使式 (II) 化合物与式 (III) 化合物反应, 以生成式 (I) 的化合物或其盐,

[0332] $H_2N-NH-Het (R^6)_n$ (II)

[0333] 其中 Het 及 $(R^6)_n$ 如式 (I) 中的定义,

[0334]



[0335] 其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及 R^5 如式 (I) 中的定义。

[0336] 方法 (a) 对于这样的式 (I) 和 (II) 化合物而言是优选的, 其中 Het 为所述式 (Het-a) 的基团 (= 嘧啶 -5- 基) 并且 n 不是 0, 或其中 Het 为所述式 (Het-b) 的基团 (= 吡嗪 -3- 基) 并且 n 不是 0, 或其中 Het 为所述式 (Het-c) 的基团 (= 吡嗪 -4- 基), 或 Het 为所述式 (Het-d) 的基团 (= 哒嗪 -6- 基)。

[0337] 作为本发明方法 (a) 中起始原料用于制备式 (I) 化合物的式 (III) 的被取代的 1, 3- 二羰基化合物优选地为, 其中基团 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及 R^5 具有以上在对本发明的式 (I) 化合物进行描述时作为优选已指出的优选含义的那些。相应地, 作为本发明方法 (a) 中起始原料用于制备式 (I) 化合物的式 (II) 的被取代的杂芳基肼, 也优选地具有以上在对本发明的式 (I) 化合物进行描述时作为优选 $(R^6)_n$ 已指出的 $(R^6)_n$ 的那些含义, 并且特别优选作为基团 Het 的一个官能团。

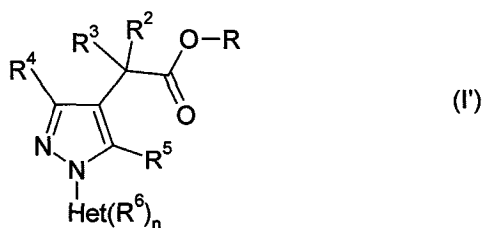
[0338] 式 (II) 的胍或其盐作为起始原料是已知的, 并且 / 或者可通过已知的方法制备 (参见, 例如 Methoden der organischen Chemie (Houben-Weyl, D. Klamann, Ed.), E16a 卷, part 1, 421 页及以后, Georg Thieme Verlag, Stuttgart 1990 及其中引用的文献; J. Am. Chem. Soc., 1954, 76, 596; Monatshefte für Chemie 1988, 119, 333; J. Heterocyclic Chem. 1988, 25, 1055; J. Heterocyclic Chem. 1989, 26, 475; Heterocycles 1994, 37, 379)。

[0339] 式 (II) 和 (III) 的化合物的反应可在没有催化剂或在催化剂 (例如一种酸作为催化剂) 的存在下进行; 优选地在一种有机溶剂中进行, 例如四氢呋喃 (THF)、二噁烷、乙腈、二甲基甲酰胺 (DMF)、甲醇及乙醇; 在 20°C 至所述溶剂的沸点之间的温度下、优选在 50°C 至 150°C 之间进行。如果使用了式 (II) 的酸加成盐, 则它们通常通过碱原位释放。合适的碱或碱性催化剂为碱金属氢氧化物、碱金属氢化物、碱金属碳酸盐、碱金属碳酸氢盐、碱金属醇盐、碱土金属氢氧化物、碱土金属氢化物、碱土金属碳酸盐, 或有机碱, 例如三乙胺、二异丙基乙基胺或 1,8-二氮杂双环 [5.4.0] 十一碳 -7- 烯 (DBU)。

[0340] 类似的方法已记载于文献中, 例如于 WO 2004/037793 中。

[0341] (b) 如果式 (I) 中的 R¹ 不为氢, 则使式 (I') 的化合物与式 (IV) 的化合物反应以生成式 (I) 化合物,

[0342]



[0343] 其中 Het、R²、R³、R⁴、R⁵ 及 R⁶ 如式 (I) 中的定义, 并且

[0344] R 为一个与基团 R¹ 不同且不为氢的选自如对 R¹ 所定义基团的基团, 或其中 R = H 的式 (I') 化合物的酸酐、酰基卤化物或活化酯 (activated ester),

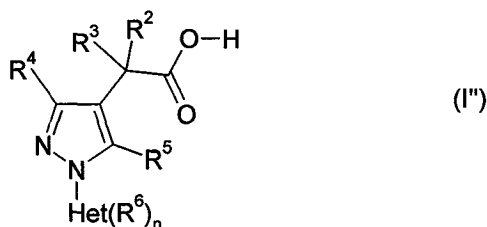
[0345] R¹-OH (IV)

[0346] 其中 R¹ 如式 (I) 中的定义,

[0347] 或者

[0348] (c) 如果式 (I) 中的 R¹ 不为氢, 则使式 (I'') 化合物——如果合适在酸基团活化之后——与式 (IV) 的化合物反应 (酯化) 以生成式 (I) 的化合物,

[0349]



[0350] 其中 Het、R²、R³、R⁴、R⁵ 及 R⁶ 如式 (I) 中的定义,

[0351] R¹-OH (IV)

[0352] 其中 R¹ 如式 (I) 中的定义,

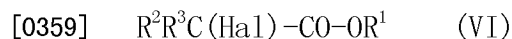
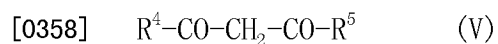
[0353] 或者

[0354] (d) 如果制备其中 $R = H$ 的式 (I) 化合物或其盐, 则使式 (I') 的化合物 [见变型方案 (b) 中的定义] 水解, 以生成式 (I) 化合物或其盐。

[0355] 式 (II)、(III) 及 (IV) 的起始原料通常是已知的, 或可与已知方法类似地制备。

[0356] 式 (I') 及 (IV) 的化合物的反应可用标准的酯交换或酯化法通过活化羧酸来进行。式 (I'') 及 (IV) 的化合物的反应可用标准的酯化法或者如果合适通过活化羧酸来进行。由化合物 (I') 制备式 (I'') 化合物可用标准的水解法进行。

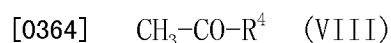
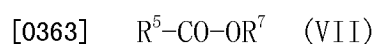
[0357] e) 式 (III) 化合物可例如通过使式 (V) 的二羰基化合物与式 (VI) 的化合物反应而制备,



[0360] 其中 R^1, R^2, R^3, R^4 及 R^5 如式 (III) 中的定义, 且 R^1 优选地为甲基或乙基; 并且 Hal 为一种离去基团, 优选地一种活性卤素, 例如氯原子或, 特别是溴原子, 或对甲苯磺酰基或甲磺酰基。

[0361] 本发明的式 (I) 化合物可通过类似于所述方法 a) 至 e) 的已知方法制备, 如记载于例如 Methoden der organischen Chemie [Methods of Organic Chemistry] (Houben-Weyl, E. Schaumann, Ed.) 卷 E8b, Hetarenes III, part 2, 399-710 页, Georg Thieme Verlag, Stuttgart 1994 及其引用的文献, 其中特别关注根据以下文献的合成: Methoden der organischen Chemie (Houben-Weyl, E. Schaumann, Ed.) 卷 E8b, Hetarenes III, part 2, 420 页及以后, Georg Thieme Verlag, Stuttgart 1994 及其引用的文献; Synthesis, 1986, 409; J. Chinese Chem. Soc., 2001, 48, 45 以及特别地 US 4146721、DE2141124、DOS 1946370 及 Justus Liebigs Ann. Chem. 1973, 1919。

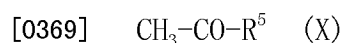
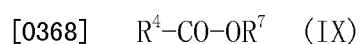
[0362] f) 式 (V) 化合物也可例如通过以下方式制备: 使式 (VII) 的化合物与式 (VIII) 的化合物在一种合适的有机碱 (例如甲醇钠或乙醇钠) 的存在下、在一种合适的溶剂 (例如甲醇、乙醇或优选地四氢呋喃) 中, 在 -10 至 50°C (优选 0°C) 之间的温度下并且如果合适在惰性气氛 (例如氮气气氛) 下反应,



[0365] 其中 R^4 及 R^5 如式 (I) 中的定义, R^7 为 (C_1-C_6) -烷基、优选甲基或乙基。

[0366] 类似于上述反应的反应已记载于文献中, 例如 Supramolecular Chemistry (2003), 15 (7-8), 529-547; J. Am. Chem. Soc. (1951), 735614-16; J. of Med. Chem. (1990), 33 (7), 1859-65; WO 00/08002。

[0367] 或者, 式 (V) 化合物还可通过使式 (IX) 的化合物与式 (X) 的化合物在类似于以上描述的 f) 所处条件的条件下反应来获得,

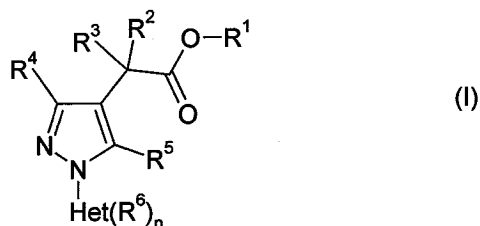


[0370] 其中 R^4 及 R^5 如式 (I) 中的定义; R^7 为 (C_1-C_6) -烷基, 优选甲基或乙基。

[0371] 类似于上述反应的反应已记载于文献中, 例如 J. Am. Chem. Soc. (1950), 721352-6 中。

[0372] g) 为制备通式 (I) 的化合物,

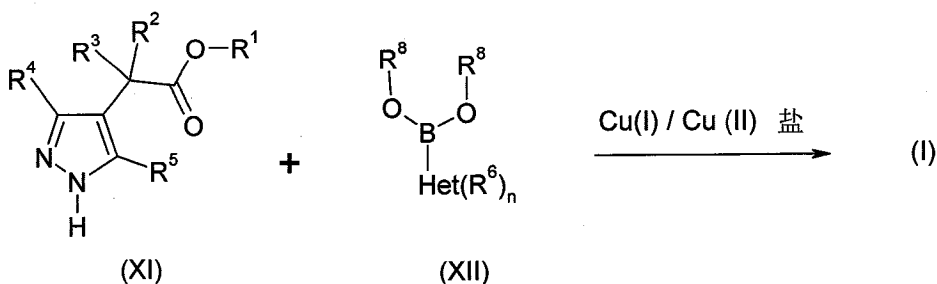
[0373]



[0374] 其中 Het、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及 R^6 如式 (I) 中的定义，

[0375] 也可例如使通式 (XI) 的化合物与式 (XII) 的硼衍生物在一种合适的 Cu(I) 或 Cu(II) 盐及一种有机碱的存在下——如果合适在一种溶剂中——进行反应，如以下方案中所示：

[0376]



[0377] 其中 Het、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 具有以上对式 (I) 所给出的含义，并且 R_8 为 H 或 (C_1 - C_6)-烷基（优选甲基），或者两个烷基基团 R^8 环状连接。

[0378] 所述反应在一种合适的无机或有机铜 (I) 或铜 (II) 盐——优选 CuI、 Cu_2O ，特别优选 $Cu(OAc)_2$ ——的存在下进行，其中使用大于一当量、优选 1.5 至 2 当量的硼衍生物 (XII)。

[0379] 为此目的，加入一种合适的有机碱，例如吡啶或叔丁醇钾；并且为了使金属转移作用更有效，加入氟阴离子源，优选氟化铯。

[0380] 所述反应在一种合适的溶剂（优选一种卤化溶剂，例如三氯甲烷或优选地二氯甲烷）中、在 0 至 40°C 的温度范围内（优选在 20 至 30°C 的温度范围内）并且如果合适在惰性气氛（例如氮气气氛）下进行，直至反应完成，在一些情况下其可能需要较长的反应时间。

[0381] 用于铜-诱导的 C-N 偶联的类似方法已记载于文献中，例如 Tet. Lett. 1998, 39, 2941；Tet. Lett. 1998, 39, 2933；Tet. Lett. 44(2003) 3863-3865；J. Comb. Chem. 2004, 6, 385-390；Tet. Lett. 41(2000) 9053-9057 中。

[0382] 用于在氟阴离子的存在下进行铜-诱导的 C-N 偶联的类似方法已记载于文献中，例如 Eur. J. Org. Chem. 2007, 1318-1323 及 Org. Lett. 2007, 9(5), 761 中。

[0383] 通式 (XI) 的化合物可通过本领域技术人员已知的方法制备，例如通过使通式 (III) 的化合物——其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及 R^5 如式 (I) 中的定义——与胍（水合物）如 Can. J. Chem. 2001, 79(2), 183-194 中所述的进行反应。

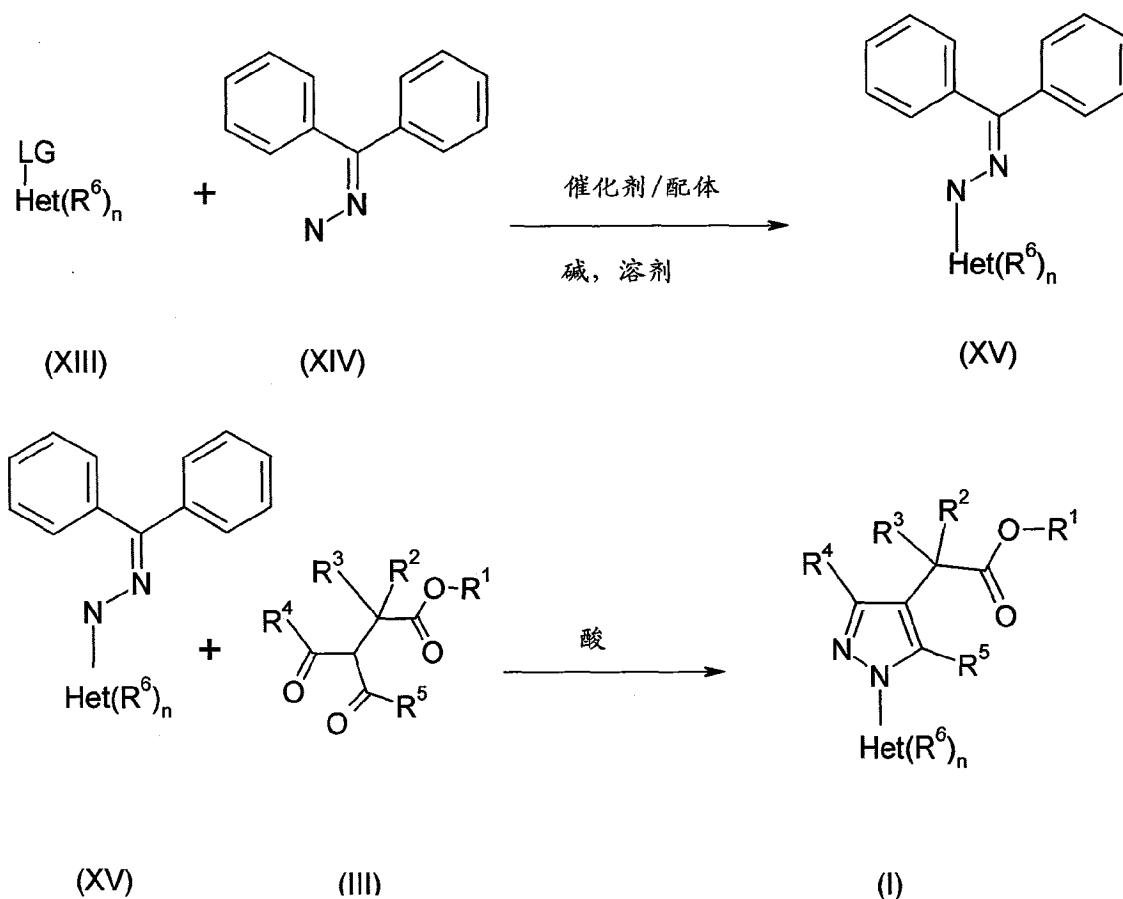
[0384] 通式 (XII) 的化合物是本领域技术人员已知的，并且有些是市售可得或可通过本领域技术人员已知的方法制备，例如如于以下文献中所记载的：a) Science of Synthesis, Houben-Weyl (Methods of Molecular Transformations), Category 2, 卷 6, Ed. E. Schaumann；b) Houben-Weyl (Methoden der organische Chemie [Methods of Organic Chemistry]), 卷 13, Organoborverbindungen [Organoboron Compounds] I-Part

3a, Ed. E. Schaumann。

[0385] h) 用于制备其中 Het、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵ 及 R⁶ 如式 (I) 中的定义的式 (I) 化合物的一种合适的起始原料也可为例如通式 (XV) 的化合物, 其通过使其中 R⁶ 具有上述式 (I) 中的含义的式 (XIII) 的化合物在一种含有合适碱的合适的催化剂 / 配体体系存在下且在一种合适的溶剂中与二苯甲酮腙 (XIV) 反应来制备。

[0386] 通式 (XV) 的化合物与通式 (III) 的化合物在一种酸的存在下——如果合适在一种溶剂中——生成通式 (I) 的化合物, 如以下方案中所示:

[0387]



[0388] 在此, Het、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶ 具有以上对于式 (I) 所给出的含义, LG 为一个离去基团, 其中合适的离去基团有氯、溴、碘、苯基磺酸盐基、甲苯基磺酸盐基及三氟甲磺酸盐基 (triflate) 等。

[0389] 式 (XIII) 的化合物可在一种催化剂及一种合适的催化剂 / 配体体系的存在下与二苯甲酮腙 (XIV) 反应, 生成式 (XV) 的化合物。所述反应优选地用以下物质进行: 用钯催化剂例如乙酸钯 (II), 并用一种膦配体例如 2,2'-双(二苯基膦基)-1,1'联萘 (BINAP)、1,1'-二苯基膦基二茂铁 (DPPF)、2-二叔丁基膦基联苯 (JohnPhos)、2-二环己基膦基-2'-二甲氨基联苯 (DavePhos)、2-二环己基膦基-2',4',6'-三异丙基联苯 (XPhos)、2-二环己基膦基-2'-甲基联苯 (MePhos)、4,5-双(二苯基膦基)咕吨 (XANTPHOS)。使用碱(例如叔丁醇钠)是有利的。所述反应在一种惰性气氛(例如氮气气氛)下、无水、在一种合适的溶剂(例如甲苯)中进行。

[0390] 二苯甲酮腙是市售可得的。

[0391] 式 (XV) 的化合物可直接与式 (III) 的化合物进一步反应,生成式 (I) 的化合物。所述反应在一种合适的无机或有机(非)水性酸——优选对甲苯磺酸、硫酸,特别优选盐酸——的存在下进行,其中使用 1 至 10、特别优选 5 当量的酸。所述反应在一种合适的溶剂中(例如乙醚、二噁烷或、优选地四氢呋喃中)、在 0 至 80°C(优选 50°C)的温度范围下——并且如果合适在一种惰性气氛(例如氮气气氛)下——进行。

[0392] 脘与 1,3-二酮的类似环化反应生成吡唑已记载于文献中,例如 W02001/32627; Angew. Chem. 110(1998)2249-2252; Tet. Lett. 43(2002)2171-2173; J. Am. Chem. Soc. 1981, 103,7743-7752; Organic Process Research and Development 2004,8,1065-1071; Tet. Lett. 45(2004)5935-5937; W02007/064872、US 6489512、W02006/114213。

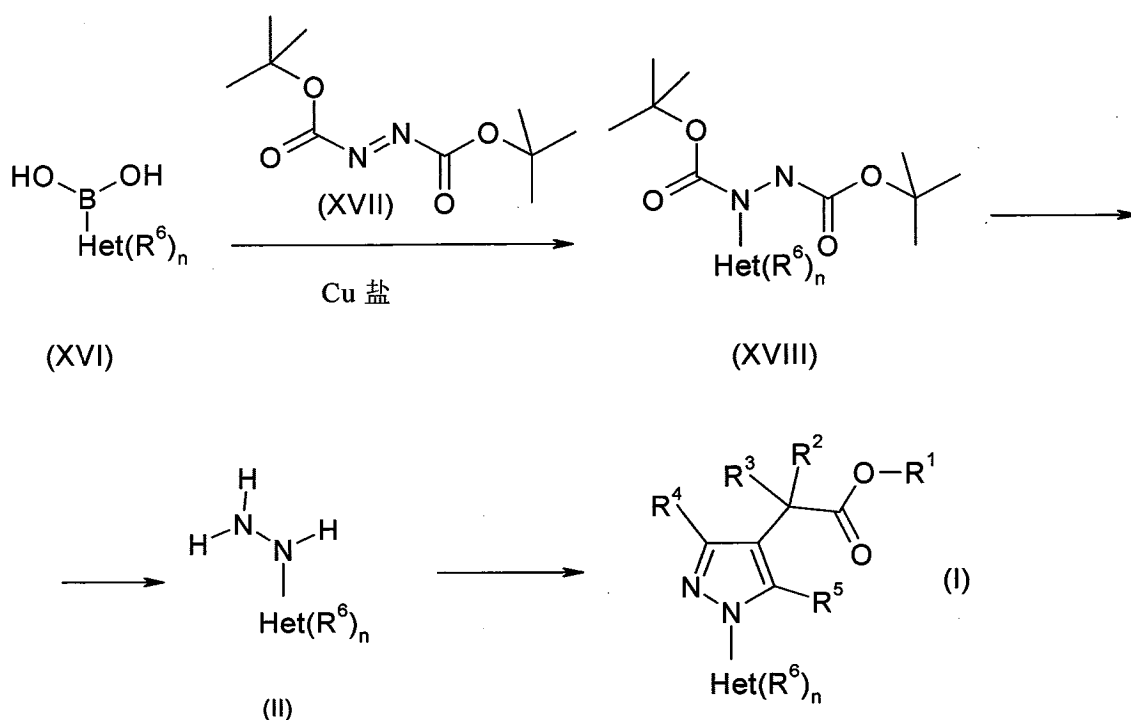
[0393] 式 (XV) 的化合物也可用本领域技术人员已知的方法、在酸的存在下——优选地在部分含水的条件下——转化为式 (II) 的化合物。式 (II) 的化合物还可根据上述方法 a) 进一步反应,以生成式 (I) 化合物。

[0394] 通式 (XIII) 的化合物是本领域技术人员已知的,其中一些为市售可得的,或可通过本领域技术人员已知的方法来制备,例如如 Science of Synthesis, Houben-Weyl(Methods of Molecular Transformations), Category 2, 卷 16, Ed. E. Schaumann 中所记载的。

[0395] 通式 (XV) 的化合物可如以下文献的描述进行制备,例如 Tet. Lett. 45(2004)5935-5937; Angew. Chem. Int. Ed. 2006,45,6523-6527; J. Am. Chem. Soc. (2003)125,13978-13980; J. Am. Chem. Soc. (2003),125,6653-6655; Org. Lett. 3(9)(2001)1351; Tet. Lett. 45(2004)5935-5937; Tetr. Lett. 43(2002)2171-2173; Angew. Chem. Int. Ed. 1998,37(15)2090; W02001/32627; J. Am. Chem. Soc. (1998)120,6621; W02007/064872; US 6489512; W02006/114213; US2005/0192294, J. Am. Chem. Soc. 2003, 125,6653-6655; Org. Lett. 2001,3(9),1351-1354。

[0396] i) 为制备其中 Het、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵ 及 R⁶ 如针对式 (I) 定义的所述式 (I) 化合物,也可例如使通式 (XVI) 的化合物与偶氮二羧酸二叔丁酯(DBAD, XVII) 在一种合适的铜盐存在下——在一种合适的溶剂中——反应,以生成通式 (XVIII) 化合物;其中通式 (XVI) 中 R⁶ 如式 (I) 中的定义,式 (XVIII) 中 R⁶ 如式 (I) 中的定义。这样生成其中 R⁶ 如式 (I) 中定义的式 (II) 化合物或其盐,其可根据方法 a) 转化成其中 R¹、R²、R³、R⁴、R⁵ 及 R⁶ 如式 (I) 定义的式 (I) 化合物,如以下方案中所示:

[0397]



[0398] 所述反应在例如一种合适的无机铜盐（如 Cu(OAc)_2 或 $\text{Cu(OAc)}_2 \cdot \text{H}_2\text{O}$ ）的存在下、在一种合适的溶剂（例如一种醇如甲醇）中、在 0 至 40°C （优选 $20\text{--}25^\circ\text{C}$ ）的温度范围内——并且如果合适在一种惰 性气氛（例如氮气）下——进行。

[0399] 使用市售可得的 (E)-二氮烯-1,2-二羧酸二叔丁酯 (DTBAD) 的类似反应已记载于文献中, 例如 *Org. Lett.* (2006) 8(1), 43-45 ; *J. Org. Chem.* 2005, 70, 8631-8634。

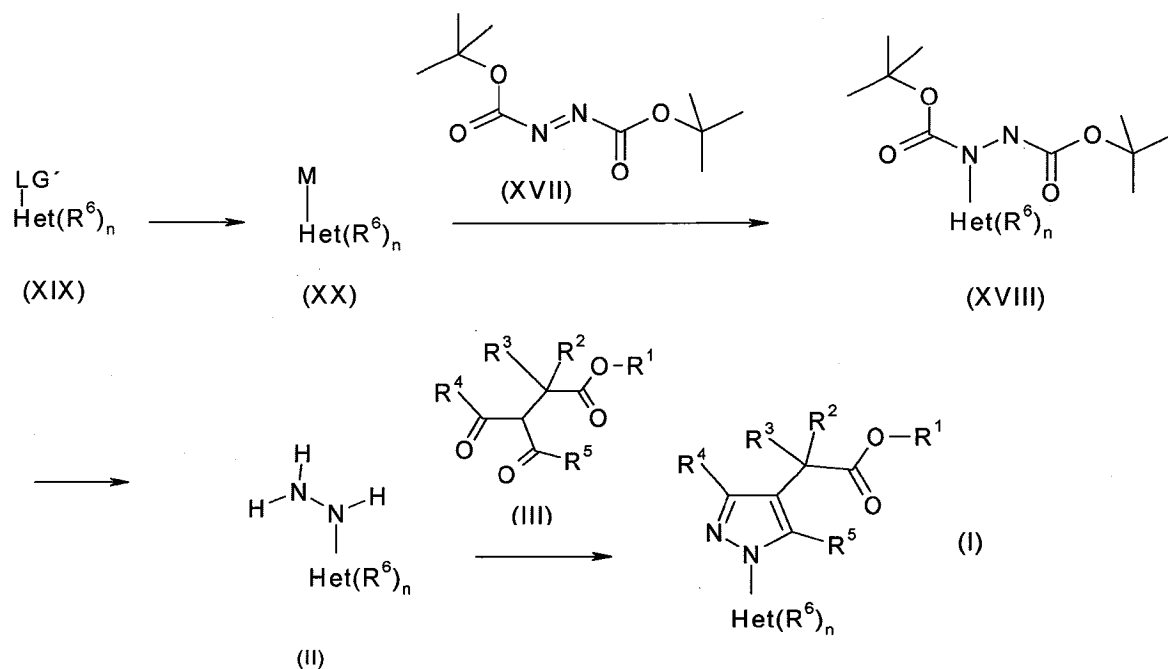
[0400] 通式 (XVI) 的化合物为市售可得的, 并且 / 或者可通过本领域技术人员已知的方法制备, 例如如以下文献中所记载的: a) *Science of Synthesis, Houben-Weyl (Methods of Molecular Transformations)*, Category 2, 卷 6, Ed. E. Schaumann; b) *Houben-Weyl (Methoden der organische Chemie [Methods of Organic Chemistry])*, 卷 13, *Organoborverbindungen [Organoboron Compounds] I-Part 3a*, Ed. E. Schaumann。

[0401] 通式 (XVIII) 的化合物可用本领域技术人员已知的方法转化为通式 (II) 的化合物, 例如如以下文献中所记载的: *J. Med. Chem.* 1998, 41, 2858-2871 ; *Tetrahedron* 44(17), 5525(1988) ; *J. Med. Chem.* 1996, 39, 1172-1188 ; *J. Org. Chem.* 2004, 69, 5778-5781。

[0402] 通式 (II) 的化合物或其盐可通过上述方法 a) 转化为式 (I) 的化合物。

[0403] j) 为制备其中 Het 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及 R^6 如式 (I) 中定义的所述式 (I) 化合物, 也可例如使通式 (XIX) 的化合物——其中 R^6 如式 (I) 中的定义并且 LG' 为一种合适的基团, 其中合适的基团为硼和碘等——与一种合适的金属或一种合适的金属转移试剂反应, 生成式 (XX) 的化合物; 其本身在一种合适的溶剂的存在下与 (E)-二氮烯-1,2-二羧酸二叔丁酯 (DTBAD, XVII) 反应, 生成其中 R^6 如式 (I) 中定义的通式 (XVIII) 的化合物。这生成其中 R^6 如式 (I) 中定义的式 (II) 化合物或其盐, 其可根据方法 a) 转化为其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及 R^6 如式 (I) 中定义的式 (I) 化合物, 如以下方案中所示:

[0404]



[0405] 成为通式 (XX) 化合物的转化在例如一种合适的金属转移试剂 (例如一种烷基锂碱、优选 BuLi) 或一种金属 (优选 Li、Mg 或 Zn) 的存在下进行。以此方法形成的亲核体进一步与 (E) 二氮烯-1,2-二羧酸二叔丁酯 (DTBAD, XVIII) 反应,生成通式 (XVIII) 的化合物。使用市售可得的偶氮二羧酸二叔丁酯 (DBAD) 的类似反应已记载于文献中,例如 Tet. Lett. 1987, 28(42), 4933 ;Tet. Lett. 39(1998)9157-9160。

[0406] 通式 (XIX) 的化合物为市售可得的,并且 / 或者可通过本领域技术人员已知的方法获得,例如如以下文献中所记载的:Science of Synthesis, Houben-Weyl (Methods of Molecular Transformations), Category 2, 卷 16, Ed. E. Schaumann。

[0407] 通式 (XVIII) 的化合物可通过本领域技术人员已知的方法转化为通式 (II) 的化合物,例如如以下文献中所记载的:J. Med. Chem. 1998, 41, 2858-2871 ;Tetrahedron 44(17), 5525(1988) ;J. Med. Chem. 1996, 39, 1172-1188 ;J. Org. Chem. 2004, 69, 5778-5781。

[0408] 通式 (II) 的化合物或其盐可通过上述方法 a) 转化为式 (I) 的化合物。

[0409] 通式 (III) 的起始原料可通过公知的方法由相应的 1,3-二酮与 2-卤代乙酸衍生物 (例如溴代乙酸衍生物) 的烷基化获得 (参见,例如 DE-OS1946370, 第 13 页)。为此目的作为起始原料所需的 1,3-二酮 (V) 可通过上述方法 f) 制备,或是市售可得的并且 / 或者可通过已知方法制备 (见,例如 US 4146721、DE2141124、DOS1946370 或 J. Am. Chem. Soc., 1948, 70, 4023 ;Justus Liebigs Ann. Chem. 1973, 1919 ;Justus Liebigs Ann. Chem. 1976, 13 ;J. Chem. Soc. Perkin Trans. 2, 1993, 6, 1067 ;Heteroatom Chemistry, 1997, 8, 147)。

[0410] 也可用于制备式 (I) 的对映异构体的是常规的旋光拆分方法 (参见立体化学教科书),例如以下用于将混合物分离成非对映异构体的方法,例如物理方法,如结晶、色谱法 (特别是柱色谱及高压液相色谱)、(如果合适在减压下进行的) 蒸馏、萃取和其它方法;可分离对映异构体的剩余混合物,通常通过在手性固相上进行色谱分离。适于制备量或工业规模的方法例如非对映异构体盐的结晶,其可用旋光酸——且如果合适 (条件是存在酸性基团) 使用旋光碱——由化合物 (I) 而获得。

[0411] 适于通过非对映异构体盐的结晶而进行旋光拆分的旋光酸为,例如,樟脑磺酸、樟脑酸、溴代樟脑磺酸、奎尼酸、酒石酸、二苯甲酰基酒石酸及其它类似的酸;合适的旋光碱为,例如,奎宁、辛可宁、奎尼定、二甲氧基马钱子碱、1-苯基乙基胺及其它类似的碱。结晶然后多数情况下在水或水-有机溶剂中进行,其中溶解度较低的非对映异构体首先沉淀,如果合适在接种之后。式(I)化合物的一种对映异构体然后,通过酸化或使用碱,从所述沉淀的盐中释放出来或另一种从晶体中释放出来。

[0412] 以下酸适于制备所述式(I)化合物的酸加成盐:氢卤酸(例如氢氯酸或氢溴酸),此外还有磷酸、硝酸、硫酸,单或二官能羧酸及羟基羧酸(例如乙酸、顺式丁烯二酸、丁二酸、富马酸、酒石酸、柠檬酸、水杨酸、山梨酸或乳酸),以及磺酸(例如对甲苯磺酸和1,5-亚萘基二磺酸)。式(I)的酸加成化合物可简单地通过形成盐的常规方法获得,例如通过将式(I)的化合物溶解于一种合适的有机溶剂中(例如甲醇、丙酮、二氯甲烷或苯中),并在0至100°C的温度下加入所述酸,且它们可以一种已知的方法(例如通过过滤)分离,及如果适用一种惰性有机溶剂洗涤而纯化。

[0413] 式(I)化合物的碱加成盐优选在惰性极性溶剂(例如水、甲醇或丙酮)中于0至100°C的温度下制备。适于制备本发明的盐的碱的实例为碱金属碳酸盐(例如碳酸钾)、碱金属氢氧化物及碱土金属氢氧化物(例如NaOH或KOH)、碱金属氢化物及碱土金属氢化物(例如NaH)、碱金属醇盐及碱土金属醇盐(例如甲醇钠或叔丁醇钾)、或氨、乙醇胺或式 $[NRR'R''R''']^+OH^-$ 的氢氧化季铵。

[0414] “惰性溶剂”在以上方法变化方案中所指的含义是这样的溶剂,其各自在特定的反应条件下呈惰性、但不必在任何反应条件下都呈惰性。

[0415] 可根据上述反应合成的一批式(I)的化合物和/或其盐也可平行地制备,其可手动实现或者部分或完全自动地实现。在此,可以例如使得反应的步骤、产品或中间体的后处理或纯化的步骤自动化。总之,这应理解为表示一种如例如由D. Tiebes在Combinatorial Chemistry-Synthesis, Analysis, Screening(Editor Günther Jung), Wiley 1999, 1-34页中所描述的方法。

[0416] 一些市售可得的装置可用于所述平行反应步骤及后处理,例如产自Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, USA的Calpyso reaction blocks、或产自Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 113AZ, England的reaction stations、或产自Perkin Elmar, Waltham, Massachusetts 02451, USA的MultiPROBE Automated Workstations。色谱装置,例如产自ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA等的色谱装置,是可得的用于式(I)的化合物及其盐或在制备过程中所产生中间体的平行纯化。

[0417] 所列装置导致其中各进程均自动化的模块过程,但是在这些过程之间必须进行手动操作。这可以通过使用部分或完全集成的自动化系统来避免,其中相关的自动化模块可由例如机器人来操作。这种自动化系统可从例如Caliper, Hopkinton, MA 01748, USA获得。

[0418] 单个或多个合成步骤的完成可借助于使用聚合物支载的试剂/清除剂树脂。专业文献描述了一系列实验方案,例如在ChemFiles, Vol. 4, No. 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis(Sigma-Aldrich)中。

[0419] 除了在此中所描述的方法,式(I)的化合物及其盐的制备可通过固相支载法(solid-phase-supported method)完全或部分实现。为此目的,该合成或适于相关步骤的合成中的单个中间体或所有中间体都与合成树脂结合。固相支载合成法被充分地描述于专业文献中,例如 Barry A. Bunin 在“The Combinatorial Index”, Academic Press, 1998, 及 Combinatorial Chemistry-Synthesis, Analysis, Screening(Editor Günther Jung), Wiley, 1999。固相支载合成法的使用使得一系列从所述文献中已知的方案可能实现,其同样可手动或以自动化的方式进行。例如,所述反应可在产自 Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, USA 的微反应器中借助于 IRORI 技术来进行。

[0420] 在固体上及在液相中进行的单个或多个合成步骤均可借助于使用微波技术实现。一系列实验方案记载于专业文献中,例如 Organic and Medicinal Chemistry(编辑 C. O. Kappe 和 A. Stadler), Wiley, 2005 中的 Microwaves。

[0421] 通过所述方法进行的制备在此提供了被称为库的物质集合形式的式(I)的化合物及其盐。本发明因此还提供了包含至少两种式(I)化合物和/或其盐的库。

[0422] 本发明的式(I)的化合物和/或其盐,以下总称为“本发明化合物(I)”或简称“化合物(I)”,针对较宽范围的经济上重要的单子叶和双子叶一年生有害植物具有显著的除草活性。该活性化合物还有效地作用于由根茎、根状茎或其它多年生器官发芽且难以防治的多年生有害植物。

[0423] 因此,本发明还涉及一种用于防治不想要的植物或用于调节植物生长(优选用于植物作物中)的方法,其中将一种或多种本发明化合物施用于植物(例如有害植物,如单子叶或双子叶杂草或不想要的作物植物)、种子(例如谷粒、种子或无性繁殖体,如块茎或带芽的枝条部位)或植物生长区域(例如栽培区域)。在本文中,本发明的化合物例如可在种植前(如果合适,还通过引入土壤中)、芽前或芽后施用。以下将提及一些可由本发明化合物防治的单子叶和双子叶杂草植物群的个别代表性实例,但所述提及并非意欲限于某些属种。

[0424] 以下属的单子叶有害植物:山羊草属(Aegilops)、冰草属(Agropyron)、剪股颖属(Agrostis)、看麦娘属(Alopecurus)、假剪股颖属(Apera)、燕麦属(Avena)、臂形草属(Brachiaria)、雀麦属(Bromus)、蒺藜草属(Cenchrus)、鸭跖草属(Commelina)、狗牙根属(Cynodon)、莎草属(Cyperus)、龙爪茅属(Dactyloctenium)、马唐属(Digitaria)、稗属(Echinochloa)、荸荠属(Eleocharis)、蟋蟀草属(Eleusine)、画眉草属(Eragrostis)、野黍属(Eriochloa)、羊茅属(Festuca)、飘拂草属(Fimbristylis)、异蕊花属(Heteranthera)、白茅属(Imperata)、鸭嘴草属(Ischaemum)、千金子属(Leptochloa)、黑麦草属(Lolium)、雨久花属(Monochoria)、黍属(Panicum)、雀稗属(Paspalum)、藨草属(Phalaris)、梯牧草属(Phleum)、早熟禾属(Poa)、筒轴茅属(Rottboellia)、慈姑属(Sagittaria)、莞草属(Scirpus)、狗尾草属(Setaria)、高粱属(Sorghum)。

[0425] 以下属的双子叶杂草:白麻属(Abutilon)、苋属(Amaranthus)、豚草属(Ambrosia)、单花葵属(Anoda)、春黄菊属(Anthemis)、Aphanes、蒿属(Artemisia)、滨藜属(Atriplex)、雏菊属(Bellis)、鬼针属(Bidens)、芥属(Capsella)、飞廉属(Carduus)、决明属(Cassia)、矢车菊属(Centaurea)、藜属(Chenopodium)、蓟属(Cirsium)、旋花属(Convolvulus)、曼陀罗属(Datura)、山蚂蝗属(Desmodium)、刺酸模属(Emex)、糖芥

属 (*Erysimum*)、大戟属 (*Euphorbia*)、鼬瓣花属 (*Galeopsis*)、牛膝菊属 (*Galinsoga*)、拉拉藤属 (*Galium*)、芙蓉属 (*Hibiscus*)、番薯属 (*Ipomoea*)、地肤属 (*Kochia*)、野芝麻属 (*Lamium*)、独行菜属 (*Lepidium*)、母草属 (*Lindernia*)、母菊属 (*Matricaria*)、薄荷属 (*Mentha*)、山黧属 (*Mercurialis*)、Mullugo、勿忘我属 (*Myosotis*)、罂粟属 (*Papaver*)、牵牛属 (*Pharbitis*)、车前属 (*Plantago*)、蓼属 (*Polygonum*)、马齿苋属 (*Portulaca*)、毛茛属 (*Ranunculus*)、萝卜属 (*Raphanus*)、蔊菜属 (*Rorippa*)、节节菜属 (*Rotala*)、酸模属 (*Rumex*)、猪毛菜属 (*Salsola*)、千里光属 (*Senecio*)、田菁属 (*Sesbania*)、黄花稔属 (*Sida*)、白芥属 (*Sinapis*)、茄属 (*Solanum*)、苦苣菜属 (*Sonchus*)、尖瓣花属 (*Sphenoclea*)、繁缕属 (*Stellaria*)、蒲公英属 (*Taraxacum*)、菥蓂属 (*Thlaspi*)、车轴草属 (*Trifolium*)、荨麻属 (*Urtica*)、婆婆纳属 (*Veronica*)、堇菜属 (*Viola*)、苍耳属 (*Xanthium*)。

[0426] 如果将本发明化合物在发芽前施用于土壤表面,则完全阻止杂草幼苗出土,或者使杂草生长至达到子叶期但然后停止生长,并最终在三至四周后彻底死亡。

[0427] 如果将所述活性化合物芽后施用于绿色植物部位,则在处理后生长停止,所述有害植物停留在施用时间点的生长期,或在一段时间后彻底死亡,从而以此方式在较早的时间点持久地消除杂草的竞争,所述竞争对作物植物有害。

[0428] 尽管本发明的化合物针对单子叶和双子叶杂草具有显著的除草活性,但根据本发明各个化合物的结构及其施用率,经济上重要的作物的作物植物仅受到微小的损害或完全不受损害,所述经济上重要的作物例如:以下属的双子叶作物,落花生属 (*Arachis*)、甜菜属 (*Beta*)、芸苔属 (*Brassica*)、黄瓜属 (*Cucumis*)、南瓜属 (*Cucurbita*)、向日葵属 (*Helianthus*)、胡萝卜属 (*Daucus*)、大豆属 (*Glycine*)、棉属 (*Gossypium*)、番薯属 (*Ipomoea*)、莴苣属 (*Lactuca*)、亚麻属 (*Linum*)、番茄属 (*Lycopersicon*)、芒属 (*Miscanthus*)、烟草属 (*Nicotiana*)、菜豆属 (*Phaseolus*)、豌豆属 (*Pisum*)、茄属 (*Solanum*)、蚕豆属 (*Vicia*);或以下属的单子叶作物,葱属 (*Allium*)、凤梨属 (*Ananas*)、天门冬属 (*Asparagus*)、燕麦属 (*Avena*)、大麦属 (*Hordeum*)、稻属 (*Oryza*)、黍属 (*Panicum*)、甘蔗属 (*Saccharum*)、黑麦属 (*Secale*)、高粱属 (*Sorghum*)、小黑麦属 (*Triticale*)、小麦属 (*Triticum*)、玉蜀黍属 (*Zea*),特别是玉蜀黍属和小麦属。这就是为什么本发明化合物高度适用于选择性防治作物植物——如农业有益植物或观赏植物——中的不想要的植物生长的原因。

[0429] 此外,本发明的化合物(取决于其各自的结构及所用的施用率)具有显著的作物植物生长调节性能。它们以调节方式参与植物代谢并因此可用于以定向的方式影响植物成分以及便于收获,例如通过引起脱水和矮化生长。此外,它们还适合一般地防治和抑制不想要的营养生长,但在此过程中不损害植物。抑制营养生长在多种单子叶和双子叶作物中起到了重要的作用,因为例如可由此减少或完全避免倒伏。

[0430] 由于其除草和植物生长调节性能,所述活性化合物也可用于防治基因改造植物或经传统诱变而改造的植物的作物中的有害植物。一般而言,转基因植物因特别有利的特性而著称,例如对某些农药的抗性,主要是对某些除草剂的抗性;对植物病害或植物病害的致病生物的抗性,例如对某些昆虫或微生物(如真菌、细菌或病毒)的抗性。其它特别的性能涉及例如采收物的数量、品质、可贮性、组成并涉及具体成分。例如,具有提高的淀粉含量或改性的淀粉品质的转基因植物或者其收获物具有不同脂肪酸组成的转基因植物是已知

的。

[0431] 对于转基因作物,优选将本发明化合物用于以下植物的经济上重要的转基因作物中:有益植物和观赏植物,例如谷类,如小麦、大麦、黑麦、燕麦、高粱和粟、稻和玉米;或其他作物,如甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、番茄、豌豆和其他蔬菜。

[0432] 优选地,本发明的化合物用作这样的有益植物作物中的除草剂,所述有益植物对所述除草剂的植物毒性效果具有抗性,或者通过重组方式使得对其具有抗性。

[0433] 由于其除草和植物生长调节性能,所述活性化合物也可用于防治已知基因改造植物或那些仍待开发的植物的作物中的有害植物。一般而言,转基因植物因特别有利的特性而著称,例如对某些农药的抗性,主要是对某些除草剂的抗性;对植物病害或植物病害的致病生物的抗性,例如对某些昆虫或微生物(如真菌、细菌或病毒)的抗性。其它特别的性能涉及例如采收物的数量、品质、可贮性、组成并涉及具体成分。例如,具有提高的淀粉含量或改性的淀粉品质的转基因植物或者其收获物具有不同脂肪酸组成的转基因植物是已知的。其它特殊性质可为对非生物的应激物(例如热、冷、干旱、盐及紫外线照射)的耐受性或抗性。

[0434] 优选将本发明的式(I)化合物或其盐用于以下植物的经济上重要的转基因作物:有益植物和观赏植物,例如谷类,如小麦、大麦、黑麦、燕麦、高粱和粟、稻、木薯和玉米;或其他作物,如甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、番茄、豌豆和其他蔬菜。

[0435] 优选将本发明的式(I)化合物和/或其盐用作这样的有益植物作物中的除草剂,所述有益植物对所述除草剂的植物毒性效果具有抗性,或者通过重组方式使得对其具有抗性。

[0436] 产生与现有植物相比具有修饰特征的新植物的常规方法有,例如传统育种方法和产生突变体。或者,具有修饰特征的新植物可借助于重组方法产生(参见,例如EP-A-0221044、EP-A-0131624)。例如,一些文件已描述了下列方法:

[0437] - 作物植物的重组修饰以使植物中所合成的淀粉改性(例如WO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806);

[0438] - 对草铵膦(glufosinate)类(参见例如,EP-A-0242236、EP-A-242246)、或草甘膦(glyphosate)类(WO 92/00377)、或磺酰脲类(EP-A-0257993、US-A-5013659)的某些除草剂具有抗性的转基因作物植物;

[0439] - 能够产生苏云金杆菌毒素(*Bacillus thuringiensis* toxin, Bt毒素)从而使植物对某些害虫具有抗性的转基因作物植物,例如棉花(EP-A-0142924、EP-A-0193259);

[0440] - 具有改变脂肪酸组成的转基因作物植物(WO 91/13972)。

[0441] - 具有新的组分或次生代谢物(例如新的植物抗毒素,其使抗病性提高)的基因改造作物植物(EPA 309862, EPA0464461),

[0442] - 特色在于产率更高和胁迫抗性更高的光呼吸作用降低的基因改造植物(EPA 0305398),

[0443] - 产生制药上或诊断上重要的蛋白质(“分子农业医药(molecular pharming)”)的转基因作物植物,

[0444] - 因产率较高或品质更好而著称的转基因作物植物,

[0445] - 因例如上述新的特性的结合(“基因堆积(gene stacking)”)而著称的转基因

作物植物。

[0446] 可用于产生具有修饰特性的新转基因植物的大量分子生物技术原则上是已知的；见例如 I. Potrykus 及 G. Spangenberg(eds.) Gene Transfer to Plants, Springer Lab Manual(1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg. 或 Christou, “Trends in Plant Science” 1(1996) 423-431)。

[0447] 为了进行此类重组操作, 可将核酸分子引入质粒, 其能够通过重组 DNA 序列而产生突变或序列改变。例如, 可借助标准方法进行碱基置换、部分序列移除或者加入天然或合成的序列。为了将 DNA 片段彼此连接, 可以在片段上加入衔接头或连接体; 见, 例如 Sambrook 等人, 1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 第 2 版, ColdSpring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; 或者 Winnacker “Gene und Klone [Genes and Clones]”, VCH Weinheim 第 2 版, 1996。

[0448] 基因产物活性降低的植物细胞可例如通过下列方法生成: 通过表达至少一种相应的反义 RNA、用于实现共抑制效应的正义 RNA, 或者通过表达至少一种相应构建的核酶, 其特异性裂解上述基因产物的转录物。

[0449] 为此, 可首先使用含有基因产物的所有编码序列 (包括可能存在的任何侧翼序列) 的 DNA 分子, 或使用仅含有部分编码序列的 DNA 分子, 但是所述部分本身必须足够长, 以便在细胞中产生反义作用。也可使用与基因产物的编码序列具有高度同源性但并不完全相同的 DNA 序列。

[0450] 当在植物中表达核酸分子时, 合成的蛋白质可位于植物细胞的任意区室中。但为实现现在特定区室中的定位, 可例如使编码区域与确保在特定区室中定位的 DNA 序列连接。此类序列是本领域技术人员已知的 (参见, 例如 Braun 等人, EMBO J. 11(1992), 3219-3227; Wolter 等人, Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85(1988), 846-850; Sonnewald 等人, Plant J. 1(1991), 95-106)。核酸分子还可在植物细胞的细胞器中表达。

[0451] 转基因植物细胞可通过已知技术再生以得到完整植物。原则上, 转基因植物可以是任意植物种的植物, 即既可以是单子叶植物, 也可以是双子叶植物。

[0452] 例如, 可得到特征在于由于过表达、阻抑或抑制同源 (=天然) 基因或基因序列、或者表达异源 (=外源) 基因或基因序列而具有修饰特性的转基因植物。

[0453] 优选将本发明化合物 (I) 用于对以下物质具有抗性的转基因作物中: 生长调节剂, 例如麦草畏 (dicamba); 或抑制植物必需酶的除草剂, 所述植物必需酶例如乙酰乳酸合酶 (ALS)、EPSP 合酶、谷氨酰胺合酶 (GS) 或羟基苯丙酮酸双加氧酶 (HPPD); 或选自磺酰脲、草甘膦、草铵膦或苯甲酰基异噁唑类和类似活性化合物的除草剂。

[0454] 当本发明活性化合物用于转基因作物时, 除了在其他作物中观察到的对有害植物的效果之外, 还常常出现对施用于所述特定转基因作物而言特异性的效果, 例如改变的或特别拓宽的可防治杂草的范围、改变的可用于施用的施用率、优选地与转基因作物对其具有抗性的除草剂的良好结合能力以及对转基因作物植物的生长和产率的影响。

[0455] 本发明因此还涉及本发明的式 (I) 化合物和 / 或其盐作为除草剂用于防治转基因作物植物中有害植物的用途。

[0456] 本发明用于防治有害植物或用于植物生长调节的用途还包括这种情况, 即式 (I) 的活性化合物或其盐直到施用在植物上、植物中或土壤中之后才由前体物质 (“前药”) 形

成。

[0457] 本发明的化合物 (I) 可以可湿性粉剂、乳油、可喷雾液剂、粉剂或颗粒剂形式的常规制剂使用。因此,本发明还涉及含有式 (I) 化合物和或其盐的除草组合物和植物生长调节组合物。

[0458] 根据所需的生物学和 / 或物理化学参数,式 (I) 化合物及 / 或其盐可通过多种方式配制。可用剂型包括,例如:可湿性粉剂 (WP)、水溶性粉剂 (SP)、水溶性浓缩剂、乳油 (EC)、乳剂 (EW) 如水包油乳剂和油包水乳剂、可喷雾液剂、胶悬剂 (SC)、油基或水基分散体、油混溶性溶液剂、胶囊悬浮剂 (CS)、粉剂 (DP)、拌种产品、用于撒播和土壤施用的颗粒剂、微颗粒形式的颗粒剂 (GR)、喷雾颗粒剂、包衣颗粒剂和吸附颗粒剂、水分散性颗粒剂 (WG)、水溶性颗粒剂 (SG)、ULV 制剂、微胶囊剂和蜡剂 (wax)。

[0459] 所述各种剂型在原理上均是已知的,并在下列文献中有所描述,例如:Winnacker-Küchler,“Chemische Technologie” [Chemical technology], Volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 第 4 版,1986;Wade van Valkenburg,“Pesticide Formulations”, Marcel Dekker, N. Y., 1973;K. Martens,“Spray Drying” Handbook, 第 3 版,1979, G. Goodwin Ltd. London。

[0460] 所需制剂助剂——例如惰性物质、表面活性剂、溶剂和其他添加剂——也是已知的并在下列文献中有所描述,例如:Watkins,“Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers”, 第 2 版, Darland Books, Caldwell N. J., H. v. Olphen, “Introduction to Clay Colloid Chemistry”;第 2 版, J. Wiley&Sons, N. Y.;C. Marsden, “Solvents Guide”; 第 2 版, Interscience, N. Y. 1963; McCutcheon’s “Detergents and Emulsifiers Annual”, MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.;Sisley and Wood, “Encyclopedia of Surface Active Agents”, Chem. Publ. Co. Inc., N. Y. 1964;

Schönfeldt , “Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte”

[Interface-active ethylene oxide adducts],Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler,“ChemischeTechnologie” [Chemical Technology], volume 7, C. Hanser VerlagMunich,第 4 版,1986。

[0461] 可湿性粉剂为可均匀分散于水中的制剂,其除了含有活性物质之外,还含有稀释剂或惰性物质,以及离子型表面活性剂和 / 或非离子型表面活性剂 (湿润剂、分散剂),例如聚氧乙基化烷基酚、聚氧乙基化脂肪醇、聚氧乙基化脂肪胺、脂肪醇聚乙二醇醚硫酸盐、烷磺酸盐、烷基苯磺酸盐、木素磺酸钠、2,2’ - 二萘基甲烷 -6,6’ - 二磺酸钠、二丁基萘磺酸钠或油酰基甲基牛磺酸钠。为了制备可湿性粉剂,将除草活性物质精细研磨,例如在常规设备如锤式打磨机、风磨机 (blower mill) 和空气气流粉碎机 (air-jet mill) 中,并同时或随后与制剂助剂混合。

[0462] 乳油通过下述过程制备:将活性物质溶于有机溶剂 (例如丁醇、环己酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或者较高沸点的芳香化合物或烃类) 或有机溶剂混合物中,并加入一种或多种离子型和 / 或非离子型表面活性剂 (乳化剂)。可用的乳化剂的实例有:烷基芳基磺酸钙,例如十二烷基苯磺酸钙;或非离子型乳化剂,例如脂肪酸聚乙二醇酯类、烷基芳基聚乙二醇醚类、脂肪醇聚乙二醇醚类、环氧丙烷 / 环氧乙烷缩合物、烷基聚醚类、山梨糖醇酐酯类如山梨糖醇酐脂肪酸酯类或聚氧乙烯山梨糖醇酐酯类如聚氧乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯

类。

[0463] 粉剂通过将活性物质与细分散的固体物质一起研磨而获得,所述固体物质例如滑石、天然粘土(如高岭土、膨润土和叶蜡石)或硅藻土。

[0464] 胶悬剂可为水基的或油基的。它们可以通过例如使用市售可得的砂磨机湿法研磨而制备,其中如果合适加入如上文例如在其他剂型中所述的表面活性剂。乳剂,例如水包油乳剂(EW),可以借助例如搅拌器、胶体磨和/或静态混合器使用水性有机溶剂——以及如果合适上文例如在其他剂型中所述的表面活性剂——制备。

[0465] 颗粒剂可以通过将所述活性物质喷洒在吸附性的颗粒状惰性物质上、或通过使用粘着剂将活性物质浓缩物施用于载体表面而制备,所述载体例如砂、高岭土或颗粒状惰性物质,所述粘着剂例如聚乙烯醇、聚丙烯酸钠或矿物油。也可以将合适的活性物质以制备肥料颗粒的常规方式制备成颗粒,其如果需要可以与肥料混合的形式。

[0466] 水分散性颗粒剂通常以常规方法制备,所述常规方法例如喷雾干燥法、流化床制粒法、圆盘式制粒法、使用高速搅拌器的混合法以及不使用固体惰性物质的挤出法。为了制备圆盘式法颗粒、流体床法颗粒、挤出法颗粒和喷雾法颗粒,参见例如“Spray-Drying Handbook”第3版,1979, G. Goodwin Ltd., London; J. E. Browning, “Agglomeration”, Chemical and Engineering 1967, 第147页及其后; “Perry’s Chemical Engineer’s Handbook”, 第5版, McGraw-Hill, New York 1973, 8-57页中的方法。

[0467] 关于作物保护产品剂型的更多细节,参见例如 G. C. Klingman, “Weed Control as a Science”, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, 81-96页和 J. D. Freyer, S. A. Evans, “Weed Control Handbook”, 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, 101-103页。

[0468] 所述农业化学制剂含有通常 0.1 至 99 重量%、特别是 0.1 至 95 重量%的式(I)的活性化合物和/或其盐。

[0469] 在可湿性粉剂中,活性化合物浓度为例如约 10 至 90 重量%,至 100 重量%的余量由常规制剂成分组成。在乳油中,活性化合物浓度可为约 1 至 90 重量%、优选地为 5 至 80 重量%。粉剂形式的制剂中含有 1 至 30 重量%的活性化合物,常常优选 5 至 20 重量%的活性化合物;可喷雾溶液剂中含有约 0.05 至 80 重量%、优选地为 2 至 50 重量%的活性化合物。在水分散性颗粒剂中,活性化合物含量部分地取决于所述活性化合物以固体形式还是液体形式存在,以及所使用的制粒助剂和填充剂等。在水分散性颗粒剂中,活性化合物含量为例如 1 至 95 重量%、优选地为 10 至 80 重量%。

[0470] 此外,所述活性化合物制剂中任选地含有均为常规的各种粘合剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、防冻剂和溶剂、填充剂、载体和染料、消泡剂、挥发抑制剂以及 pH 值调节剂和粘度调节剂。制剂助剂的实例尤其记载于“Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations”, ed. D. A. Knowles, Kluwer Academic Publishers (1998) 中。

[0471] 式(I)的化合物或其盐可以其本身,或以其与其它农药活性物质结合的制剂的形式来使用,例如与杀昆虫剂、杀螨剂、杀线虫剂、除草剂、杀菌剂、安全剂、肥料和/或生长调节剂形成的——例如以最终制剂或桶混物制剂——的形式。结合物制剂可在上述制剂的基础上、同时考虑待结合活性化合物的物理特性及稳定性而进行制备。

[0472] 可用于与本发明化合物以混合制剂或桶混物的形式结合使用的活性物质有例

如,基于抑制例如下列酶的已知活性物质:乙酰乳酸合酶、乙酰辅酶 A 羧化酶、纤维素合酶、烯醇式丙酮莽草酸-3-磷酸合酶、谷氨酰胺合酶、对羟基苯基丙酮酸双加氧酶、八氢番茄红素不饱和酶、光系统 I、光系统 II、原卟啉原氧化酶;所述活性物质描述于例如:Weed Research 26(1986)441-445 或“The Pesticide Manual”,第 14 版,The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry,2003 及其中所引用的文献中。可与本发明化合物结合的已知除草剂或植物生长调节剂有例如,以下活性物质(所述化合物以国际标准化组织(ISO)规定的通用名或以其化学名称或其代号表示),且均包括其所有使用形式,例如酸、盐、酯和异构体(如立体异构体和旋光异构体)形式。本文中,以实例方式提及一种使用形式,在一些情况下也为多种使用形式:

[0473] 乙草胺(acetochlor)、活化酯(acibenzolar)、苯并噻二唑(acibenzolar-S-methyl)、三氟羧草醚(acifluorfen, acifluorfen-sodium)、苯草醚(aclonifen)、甲草胺(alachlor)、二丙烯草胺(allidochlor)、枯杀达(alloxydim, alloxydim-sodium)、莠灭净(ametryne)、氨唑草酮(amicarbazone)、先甲草胺(amidochlor)、酰胺磺隆(amidosulfuron)、aminocyclopyrachlor、氯氨吡啶酸(aminopyralid)、杀草强(amitrole)、氨基磺酸铵、环丙嘧啶醇(ancymidol)、莎稗磷(anilofos)、磺草灵(asulam)、莠去津(atrazine)、啶啉草酮(azafenidin)、四唑嘧磺隆(azimsulfuron)、叠氮津(aziprotryne)、BAH-043、BAS-140H、BAS-693H、BAS-714H、BAS-762H、BAS-776H、BAS-800H、氟丁酰草胺(beflubutamid)、草除灵(benazolin, benazolin-ethyl)、bencarbazone、乙丁氟灵(benfluralin)、呋草黄(benfuresate)、地散磷(bensulide)、苄嘧磺隆(bensulfuron-methyl)、灭草松(bentazone)、双苯嘧草酮(benzfendizone)、双环磺草酮(benzobicyclon)、吡草酮(benzofenap)、氟磺胺草(benzofluor)、新燕灵(benzoylprop)、甲羧除草醚(bifenox)、双丙氨膦(bilanafos, bilanafos-sodium)、双草醚(bispyribac, bispyribac-sodium)、除草定(bromacil)、溴丁酰草胺(bromobutide)、溴酚肟(bromofenoxim)、溴苯腈(bromoxynil)、bromuron、特克草(buminafos)、羟草酮(busoxinone)、丁草胺(butachlor)、氟丙嘧草酯(butafenacil)、抑草磷(butamifos)、丁烯草胺(butenachlor)、仲丁灵(butralin)、丁氧环酮(butroxydim)、丁草敌(butylate)、啶草胺(cafenstrole)、双酰草胺(carbetamide)、氟啶草酮(carfentrazone, carfentrazone-ethyl)、甲氧除草醚(chlomethoxyfen)、草灭畏(chloramben)、chlorazifop、chlorazifop-butyl、氯溴隆(chlorbromuron)、氯炔灵(chlorbufam)、伐草克(chlorfenac, chlorfenac-sodium)、燕麦酯(chlorfenprop)、甲基氯苄素(chlorflurenol, chlorflurenol-methyl)、氯草敏(chloridazon)、氯嘧磺隆(chlorimuron, chlorimuron-ethyl)、矮壮素(chlormequat-chloride)、草枯醚(chlornitrofen)、chlorophthalim、氯酞酸甲酯(chlorthal-dimethyl)、绿麦隆(chlorotoluron)、氯磺隆(chlorsulfuron)、啉啉酮草酯(cinidon, cinidon-ethyl)、环庚草醚(cinmethylin)、醚磺隆(cinosulfuron)、烯草酮(clethodim)、炔草酸(clodinafop)、炔草酯(clodinafop-propargyl)、杀雄嗪酸(clofencet)、异噁草松(clomazone)、氯甲酰草胺(clomeprop)、调果酸(cloprop)、二氯吡啶酸(clopyralid)、氯酯磺草酸(cloransulam, cloransulam-methyl)、苄草隆(cumyluron)、氨基氰(cyanamide)、氰草津(cyanazine)、环丙酰胺酸(cyclanilide)、环草敌(cycloate)、环丙嘧磺隆

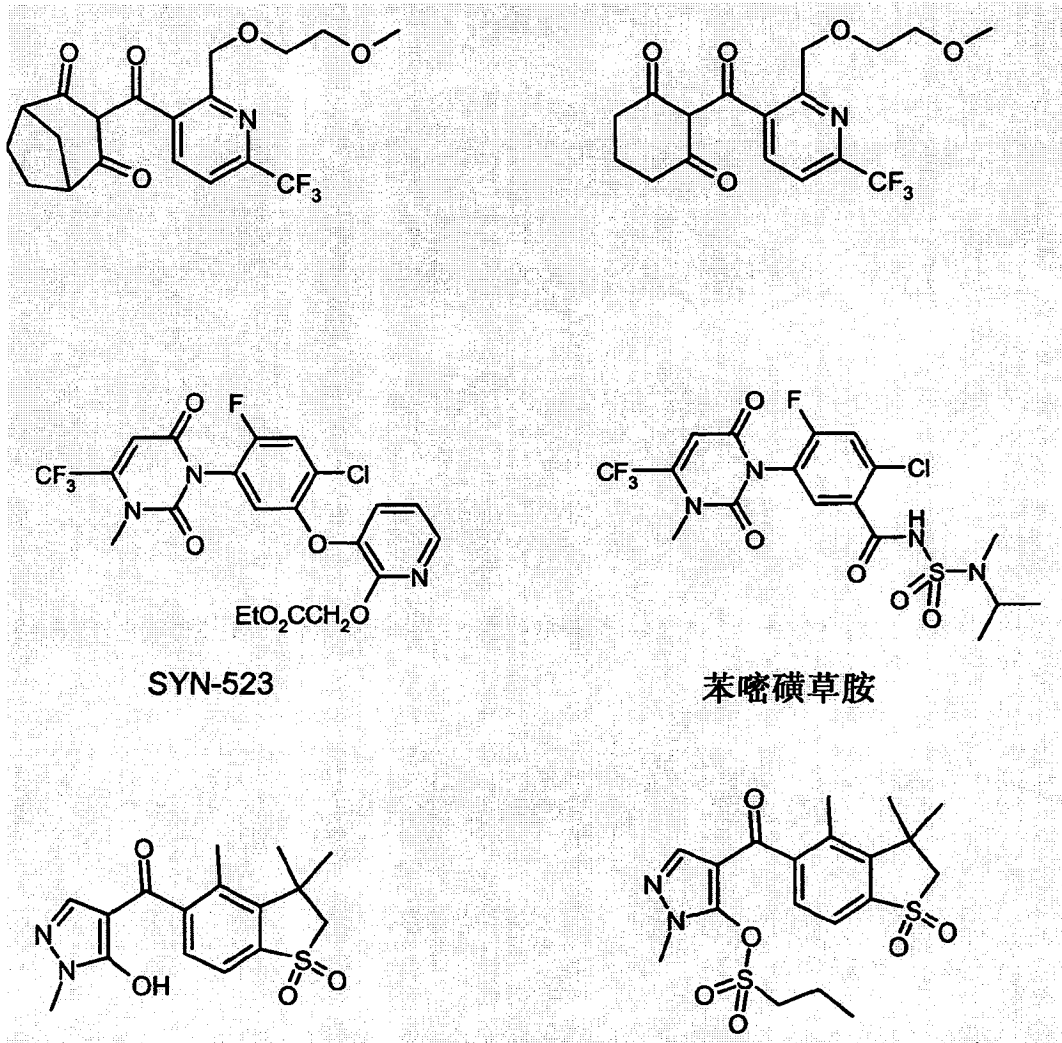
(cyclosulfamuron)、噻草酮 (cycloxydim)、环莠隆 (cycluron)、cyhalofop、氰氟草酯 (cyhalofop-butyl)、莎草快 (cyperquat)、环丙津 (cyprazine)、环唑塞胺 (cyprazole)、2,4-D、2,4-DB、杀草隆 (daimuron/dymron)、茅草枯 (dalapon)、丁酰肼 (daminozide)、棉隆 (dazomet)、正癸醇、甜菜安 (desmedipham)、敌草净 (desmetryn)、detosyl-pyrazolate (DTP)、燕麦敌 (diallate)、麦草畏 (dicamba)、敌草腈 (dichlobenil)、2,4-滴丙酸 (dichlorprop)、精2,4-滴丙酸 (dichlorprop-P)、氯甲草 (diclofop)、禾草灵 (diclofop-methyl)、diclofop-P-methyl、双氯磺草胺 (diclosulam)、乙酰甲草胺 (diethatyl, diethatyl-ethyl)、枯莠隆 (difenoxuron)、野燕枯 (difenzoquat)、吡氟酰草胺 (diflufenican)、二氟吡隆 (diflufenzopyr, diflufenzopyr-sodium)、噁唑隆 (dimefuron)、调伏酸 (dikegulac-sodium)、噁唑隆 (dimefuron)、哌草丹 (dimepiperate)、二甲草胺 (dimethachlor)、异戊乙净 (dimethametryn)、二甲吩草胺 (dimethenamid)、精二甲吩草胺 (dimethenamid-P)、噁节因 (dimethipin)、dimetrasulfuron、氨基灵 (dinitramine)、地乐酚 (dinoseb)、特乐酚 (dinoterb)、双苯酰草胺 (diphenamid)、异丙净 (dipropetryn)、敌草快 (diquat)、diquat-dibromide、氟硫草定 (dithiopyr)、敌草隆 (diuron)、DNOC、草止津 (eglinazine-ethyl)、茵多酸 (endothal)、EPTC、戊草丹 (esprocarb)、乙丁烯氟灵 (ethalfluralin)、胺苯磺隆 (ethametsulfuron, ethametsulfuron-methyl)、乙烯利 (ethephon)、磺噻隆 (ethidimuron)、乙噻草酮 (ethiozin)、乙氧呋草黄 (ethofumesate)、氟乳醚 (ethoxyfen)、氟乳醚乙酯 (ethoxyfen-ethyl)、乙氧嘧磺隆 (ethoxysulfuron)、乙氧苯草胺 (etobenzanid)、F-5331 即 N-[2-氯-4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-4,5-二氢-5-氧-1H-四唑-1-基]苯基]乙磺酰胺、2,4,5-涕丙酸 (fenoprop)、噁唑禾草灵 (fenoxaprop, fenoxaprop-ethyl)、精噁唑禾草灵 (fenoxaprop-P, fenoxaprop-P-ethyl)、四唑酰草胺 (fentrazamide)、非草隆 (fenuron)、flamprop、高效麦草氟异丙酯 (flamprop-M-isopropyl)、高效麦草氟甲酯 (flamprop-M-methyl)、啶嘧磺隆 (flazasulfuron)、双氟磺草胺 (florasulam)、吡氟禾草灵 (fluazifop)、精吡氟禾草灵 (fluazifop-P)、吡氟禾草灵丁酯 (fluazifop-butyl)、精吡氟禾草灵丁酯 (fluazifop-P-butyl)、异丙吡草酯 (fluazolate)、氟酮磺隆 (flucarbazone, flucarbazone-sodium)、氟吡磺隆 (flucetosulfuron)、氯乙氟灵 (fluchloralin)、氟噻草胺 (flufenacet (thiaflumide))、氟吡啶草酯 (flufenpyr, flufenpyr-ethyl)、氟节胺 (flumetralin)、唑嘧磺草胺 (flumetsulam)、氟烯草酸 (flumiclorac, flumiclorac-pentyl)、丙炔氟草胺 (flumioxazin)、炔草胺 (flumipropyn)、氟草隆 (fluometuron)、三氟硝草醚 (fluorodifen)、乙羧氟草醚 (fluoroglycofen, fluoroglycofen-ethyl)、氟胺草唑 (flupoxam)、flupropacil、四氟丙酸 (flupropanate)、氟啶嘧磺隆 (flupyrsulfuron, flupyrsulfuron-methyl-sodium)、9-羟基笏甲酸 (flurenol)、笏丁酯 (flurenol-butyl)、氟啶草酮 (fluridone)、氟咯草酮 (flurochloridone)、氯氟吡氧乙酸 (fluroxypyr, fluroxypyr-meptyl)、呋嘧醇 (flurprimidol)、呋草酮 (flurtamone)、噻草酸 (fluthiacet)、噻草酸甲酯 (fluthiacet-methyl)、噻唑草酰胺 (fluthiamide)、氟磺胺草醚 (fomesafen)、甲酰氨磺隆 (foramsulfuron)、氯吡脲 (forchlorfenuron)、杀木膦 (fosamine)、呋氧草醚

(furyloxyfen)、赤霉素(gibberellic acid)、草铵膦、L-草铵膦(L-glufosinate, L-glufosinate-ammonium)(草铵膦-P(glufosinate-P))、草铵膦(glufosinate-ammonium)、草铵膦-P-钠盐(glufosinate-P-sodium)、草甘膦、草甘膦异丙胺盐(glyphosate-isopropylammonium)、H-9201、氟硝磺酰胺(halosafen)、氯吡嘧磺隆(halosulfuron, halosulfuron-methyl)、氟吡禾灵(haloxypop)、精氟吡禾灵(haloxypop-P)、氟吡禾灵乙氧基乙酯(haloxypop-ethoxyethyl)、吡氟氯禾灵乙氧基乙酯(haloxypop-P-ethoxyethyl)、氟吡禾灵甲酯(haloxypop-methyl)、吡氟氯禾灵甲酯(haloxypop-P-methyl)、环嗪酮(hexazinone)、HNPC-9908、HOK-201、HW-02、咪草酸(imazamethabenz, imazamethabenz-methyl)、甲氧咪草烟(imazamox)、甲氧咪草烟铵盐(imazamox-ammonium)、甲咪唑烟酸(imazapic)、咪唑烟酸(imazapyr)、咪唑烟酸-异丙基铵盐(imzapyr-isopropylammonium)、咪唑喹啉酸(imazaquin)、咪唑乙烟酸(imazethapyr)、咪唑乙烟酸铵盐(imazethapyr-ammonium)、唑吡嘧磺隆(imazosulfuron)、抗倒胺(inabenzide)、茚草酮(indanofan)、indaziflam、吲哚乙酸(IAA)、4-吲哚-3-基丁酸(IBA)、碘甲磺隆(iodosulfuron, iodosulfuron-methyl-sodium)、碘苯腈(ioxynil)、ipfencarbazone、丁脘酰胺(isocarbamid)、异丙乐灵(isopropalin)、异丙隆(isoproturon)、异噁隆(isouron)、异噁酰草胺(isoxaben)、异噁氯草酮(isoxachlortole)、异噁唑草酮(isoxaflutole)、异噁草醚(isoxapyrifop)、KUH-043、KUH-071、特胺灵(karbutilate)、ketospiradox、乳氟禾草灵(lactofen)、环草定(lenacil)、利谷隆(linuron)、马来酰肼(maleic hydrazide)、MCPA、MCPB、MCPB 甲酯、MCPB 乙酯、MCPB 钠、2-甲-4-氯丙酸(mecoprop)、2-甲-4-氯丙酸钠、mecoprop-butotyl、mecoprop-P-butotyl、精-2-甲-4-氯丙酸二甲基铵(mecoprop-P-dimethylammonium)、精-2-甲-4-氯丙酸-2-乙基己酯(mecoprop-P-2-ethylhexyl)、精-2-甲-4-氯丙酸钾、苯噻酰草胺(mefenacet)、氯磺酰草胺(mefluidide)、甲哌啶(mepiquat-chloride)、甲磺胺磺隆(mesosulfuron, mesosulfuron-methyl)、甲基磺草酮(mesotrione)、甲基苯噻隆(methabenzthiazuron)、威百亩(metam)、噁唑酰草胺(metamifop)、苯噻草酮(metamitron)、吡唑草胺(metazachlor)、灭草唑(methazole)、methiozolin、苯草酮(methoxyphenone)、甲基杀草隆(methyldymron)、1-甲基环丙烯、硫代异氰酸甲酯、吡喃隆(metobenzuron)、溴谷隆(metobromuron)、异丙甲草胺(metolachlor)、精异丙甲草胺(S-metolachlor)、磺草唑胺(metosulam)、甲氧隆(metoxuron)、嗪草酮(metribuzin)、甲磺隆(metsulfuron, metsulfuron-methyl)、禾草敌(molinate)、庚酰草胺(monalide)、monocarbamide、甲酰胺硫酸盐(monocarbamide dihydrogen sulfate)、绿谷隆(monolinuron)、单嘧磺隆(monosulfuron)、单醚磺隆酯(monosulfuron ester)、灭草隆(monuron)、MT 128、MT-5950 即 N-[3-氯-4-(1-甲基乙基)苯基]-2-甲基戊酰胺、NGGC-011、萘丙胺(naproanilide)、敌草胺(napropamide)、萘草胺(naptalam)、NC-620、NC-310, 即 4-(2,4-二氯苯甲酰基)-1-甲基-5-苄基氧基吡唑、草不隆(neburon)、烟嘧磺隆(nicosulfuron)、氟氯草胺(nipyraclofen)、甲磺乐灵(nitralin)、除草醚(nitrofen)、硝基苯酚钠(异构体混合物)、硝氟草醚(nitrofluorfen)、壬酸、氟草敏(norflurazon)、坪草丹(orbencarb)、噻苯胺磺隆(orthosulfamuron)、氨磺乐灵(oryzalin)、丙炔噁草酮(oxadiargyl)、噁草酮(oxadiazon)、环氧嘧磺隆(oxasulfuron)、噁嗪草酮

(oxaziclomefone)、乙氧氟草醚 (oxyfluorfen)、多效唑 (paclobutrazole)、百草枯 (paraquat, paraquat dichloride)、壬酸 (pelargonic acid, nonanoic acid)、二甲戊灵 (pendimethalin)、pendralin、penoxsulam、甲氯酰草胺 (pentanochlor)、环戊噁草酮 (pentoxazone)、黄草伏 (perfluidone)、烯草胺 (pethoxamid)、棉胺宁 (phenisopham)、甜菜宁 (phenmedipham, phenmedipham-ethyl)、氨基吡啶酸 (picloram)、氟吡酰草胺 (picolinafen)、唑啉草酯 (pinoxaden)、哌草磷 (piperophos)、pirifenop、pirifenop-butyl、丙草胺 (pretilachlor)、氟嘧磺隆 (primisulfuron, primisulfuron-methyl)、烯丙苯噁唑 (probenazole)、氟唑草胺 (profluazol)、环丙氰津 (procyazine)、氨基乐灵 (prodiamine)、环丙氟灵 (prifluraline)、环苯草酮 (profoxydim)、调环酸 (prohexadione)、调环酸钙 (prohexadione-calcium)、茉莉酮 (prohydrojasmon)、扑灭通 (prometon)、扑草净 (prometryn)、毒草胺 (propachlor)、敌稗 (propanil)、噁草酸 (propaquizafop)、扑灭津 (propazine)、苯胺灵 (propham)、异丙草胺 (propisochlor)、丙苯磺隆 (propoxycarbazone, propoxycarbazone-sodium)、propyrisulfuron、炔苯酰草胺 (propyzamide)、磺亚胺草 (prosulfalin)、苄草丹 (prosulfocarb)、氟磺隆 (prosulfuron)、丙炔草胺 (prynachlor)、双唑草腈 (pyraclonil)、吡草醚 (pyraflufen, pyraflufen-ethyl)、pyrasulfotole、吡唑特 (pyrazolynate, pyrazolate)、吡嘧磺隆 (pyrazosulfuron, pyrazosulfuron-ethyl)、苄草唑 (pyrazoxyfen)、pyribambenz、异丙酯草醚 (pyribambenz-isopropyl)、丙酯草醚 (pyribambenz-propyl)、嘧啶脒草醚 (pyribenzoxim)、稗草丹 (pyributicarb)、pyridafol、哒草特 (pyridate)、环酯草醚 (pyriftalid)、嘧草醚 (pyriminobac, pyriminobac-methyl)、pyrimisulfan、嘧草硫醚 (pyrithiobac, pyrithiobac-sodium)、pyroxasulfone、甲氧磺草胺 (pyroxsulam)、二氯喹啉酸 (quinchlorac)、氯甲喹啉酸 (quinmerac)、灭藻醌 (quinochloramine)、喹禾灵 (quizalofop)、喹禾灵乙酯 (quizalofop-ethyl)、精喹禾灵 (quizalofop-P)、精喹禾灵乙酯 (quizalofop-P-ethyl)、喹禾糠酯 (quizalofop-P-tefuryl)、砒嘧磺隆 (rimsulfuron)、苯嘧磺草胺 (saflufenacil)、仲丁通 (secbumeton)、烯禾啶 (sethoxydim)、环草隆 (siduron)、西玛津 (simazine)、西草净 (simetryn)、SN-106279、磺草酮 (sulcotrione)、菜草畏 (sulfallate, CDEC)、甲磺草胺 (sulfentrazone)、甲嘧磺隆 (sulfometuron, sulfometuron-methyl)、草硫膦 (sulfosate (glyphosate-trimesium))、磺酰磺隆 (sulfosulfuron)、SYN-449、SYN-523、SYP-249、SYP-298、SYP-300、牧草胺 (tebutam)、丁噁隆 (tebuthiuron)、四氧硝基苯 (tecnazene)、tefuryltrione、rembotrione、吡喃草酮 (tepraloxym)、特草定 (terbacil)、特草灵 (terbucarb)、特丁草胺 (terbuchlor)、特丁通 (terbumeton)、特丁津 (terbutylazine)、特丁净 (terbutryne)、TH-547、噁吩草胺 (thenylchlor)、thiafluamide、噁氟隆 (thiazafuron)、噁唑烟酸 (thiazopyr)、噁二唑草胺 (thidiazimin)、噁苯隆 (thidiazuron)、thiencarbazone、thiencarbazone-methyl、噁吩磺隆 (thifensulfuron, thifensulfuron-methyl)、禾草丹 (thiobencarb)、仲草丹 (tiocarbamil)、topramezone、三甲苯草酮 (tralkoxydim)、野燕畏 (triallate)、醚苯磺隆 (triasulfuron)、三嗪氟草胺 (triaziflam)、triazofenamide、苯磺隆 (tribenuron, tribenuron-methyl)、三氯乙酸 (TCA)、三氯吡氧乙酸 (triclopyr)、灭草环 (tridiphane)、

草达津 (trietazine)、三氟吡磺隆 (trifloxysulfuron, trifloxysulfuron-sodium)、氟乐灵 (trifluralin)、氟胺磺隆 (triflusulfuron)、氟胺磺隆甲酯 (triflusulfuron-methyl)、三甲隆 (trimeturon)、抗倒酯 (trinexapac, trinexapac-ethyl)、三氟甲磺隆 (tritosulfuron)、tsitodef、烯效唑 (uniconazole)、精烯效唑 (uniconazole-P)、灭草敌 (vernolate)、ZJ-0166、ZJ-0270、ZJ-0543、ZJ-0862 和以下化合物

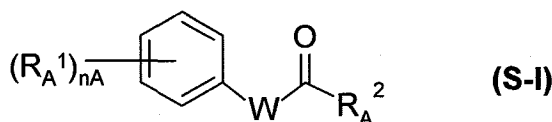
[0474]



[0475] 对有益植物和观赏植物的作物中有害植物的选择性防治特别受人关注。尽管本发明的化合物 (I) 在许多作物中已以具有非常良好且足够的选择性为特色,原则上还可能 在一些作物中并且主要在与其它选择性较小的除草剂的混合物的情况下,在作物植物上出现植物毒性。在这方面,包含化合物 (I) 的本发明化合物 (I) 的结合物或者它们与其它除草剂或农药以及安全剂的结合物特别受人关注。安全剂以作为解毒剂起作用的比例加以使用,减少了所用除草剂/农药的植物毒性副作用,例如在经济上重要的作物如谷类(小麦、大麦、黑麦、玉米、稻、高粱/粟)、甜菜、甘蔗、油菜、棉花及大豆,优选谷类。例如,下列组的化合物适于作为安全剂用于化合物 (I) 及其与其它农药的结合物:

[0476] A) 式 (S-I) 的化合物,

[0477]



[0478] 其中符号及附标具有以下含义：

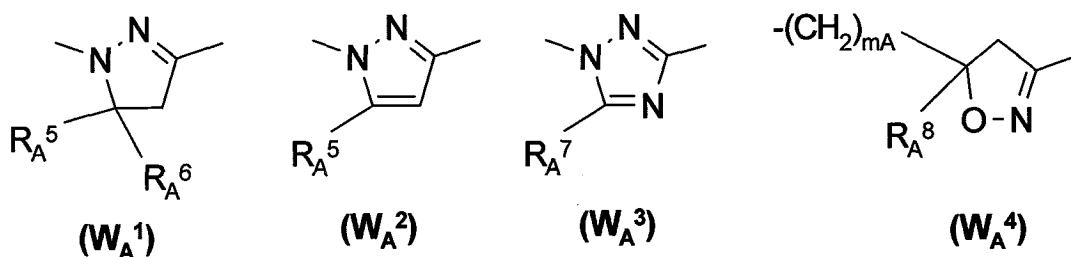
[0479] n_A 为 0 至 5、优选 0 至 3 之间的一个自然数；

[0480] R_A^1 为卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、硝基或 (C_1-C_4) -卤代烷基；

[0481] W_A 为一个未被取代的或被取代的二价杂环基团，其选自部分不饱和的或含有 1 至 3 个类型 N 或 O 的环杂原子的芳香五元环杂环，

[0482] 其中所述环中存在至少一个氮原子及最多一个氧原子；优选地为一个选自 (W_A^1) 至 (W_A^4) 的基团，

[0483]



[0484] m_A 为 0 或 1；

[0485] R_A^2 为 OR_A^3 、 SR_A^3 或 $NR_A^3R_A^4$ ，或者为一个饱和或不饱和的含有至少一个氮原子和最多 3 个杂原子——优选地选自 0 及 S——的 3 至 7 元杂环，其通过氮原子与 (S-I) 中的羰基相连，并且其为未被取代的或者被选自 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基及任选取代的苯基的基团所取代；优选为一个式 OR_A^3 、 NHR_A^4 或 $N(CH_3)_2$ 的基团，特别是式 OR_A^3 的基团；

[0486] R_A^3 为氢，或者一个未被取代的或被取代的脂族烃基，所述烃基优选地总共含有 1 至 18 个碳原子；

[0487] R_A^4 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基或者被取代的或未被取代的苯基；

[0488] R_A^5 为 H、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_1-C_8) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_8) -烷基、氰基或 $COOR_A^9$ ，其中 R_A^9 为氢、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_1-C_8) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_6) -羟基烷基、 (C_3-C_{12}) -环烷基或三- (C_1-C_4) -烷基甲硅烷基；

[0489] R_A^6 、 R_A^7 、 R_A^8 相同或不同，为氢、 (C_1-C_8) -烷基、 (C_1-C_8) -卤代烷基、 (C_3-C_{12}) -环烷基或被取代的或被未取代的苯基；

[0490] 优选：

[0491] a) 二氯代苯基吡唑啉-3-羧酸类化合物，优选化合物例如 1-(2,4-二氯代苯基)-5-(乙氧基羰基)-5-甲基-2-吡唑啉-3-羧酸乙酯 (S1-1) (“吡唑解草酯 (mefenpyr-diethyl)”，见 Pestic. Man.) 及相关化合物，如 WO 91/07874 中所述的；

[0492] b) 二氯苯基吡唑羧酸的衍生物，优选化合物例如 1-(2,4-二氯苯基)-5-甲基吡唑-3-羧酸乙酯 (S1-2)、1-(2,4-二氯苯基)-5-异丙基吡唑-3-羧酸乙酯 (S1-3)、1-(2,4-二氯苯基)-5-(1,1-二甲基乙基)吡唑-3-羧酸乙酯 (S1-4)、1-(2,4-二氯苯基)-5-苯基吡唑-3-羧酸乙酯 (S1-5) 及相关化合物，如 EP-A-333 131 和 EP-A-269 806 中所述的；

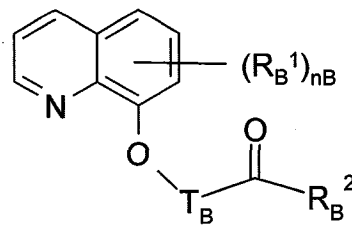
[0493] c) 三唑羧酸类化合物，优选化合物例如解草唑(-乙酯) (fenehlorazole(-ethyl

ester)), 即 1-(2,4-二氯苯基)-5-三氯甲基-(1H)-1,2,4-三唑-3-羧酸乙酯 (S1-6), 以及相关化合物, 如 EP-A-174562 和 EP-A-346 620 中所述的;

[0494] d) 5-苯甲基-2-异噁唑啉-3-羧酸类或 5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸类或 5,5-二苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸类化合物, 优选化合物例如 5-(2,4-二氯苯甲基)-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯 (S1-7) 或 5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯 (S1-8) 及相关化合物, 如 WO 91/08202 中所述; 或 5,5-二苯基-2-异噁唑啉羧酸乙酯 (S1-9) (“双苯噁唑啉(isoxadifen-ethyl)”) 或 5,5-二苯基-2-异噁唑啉羧酸正丙酯 (S1-10) 或 5-(4-氟苯基)-5-苯基-2-异噁唑啉-3-羧酸乙酯 (S1-11), 如专利申请 WO-A-95/07897 中所述。

[0495] B) 式 (S-II) 的喹啉衍生物,

[0496]



(S-II)

[0497] 其中符号和附标具有下述含义:

[0498] R_B^1 为卤素、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、硝基或 (C_1-C_4) 卤代烷基;

[0499] n_B 为 0 至 5、优选 0 至 3 的一个自然数;

[0500] R_B^2 为 OR_B^3 、 SR_B^3 或 $NR_B^3R_B^4$, 或者为一个具有至少一个氮原子和最多 3 个杂原子的饱和或不饱和的 3 至 7 元杂环, 所述杂原子优选选自 O 和 S, 所述杂环通过氮原子与 (S-II) 中的羰基连接并且为未被取代的或者被选自 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基或任选取代的苯基的基团所取代; R_B^2 优选为一个式 OR_B^3 、 NHR_B^4 或 $N(CH_3)_2$ 的基团, 特别是一个式 OR_B^3 的基团;

[0501] R_B^3 为氢或者一个未被取代的或被取代的脂族烃基, 所述烃基优选具有总共 1 至 18 个碳原子;

[0502] R_B^4 为氢、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基或者被取代的或未被取代的苯基;

[0503] T_B 为 $(C_1-$ 或 $C_2-)$ 烷二基链, 其为未被取代的或者被一个或两个 C_1-C_4 烷基基团取代或者被 $[(C_1-C_3)$ 烷氧基] 羰基取代;

[0504] 优选:

[0505] a) 8-喹啉氧乙酸类的化合物 (S2), 优选为:

[0506] (5-氯-8-喹啉氧基) 乙酸 1-甲基己酯 (通用名“解草酯(cloquintocet-mexyl)”) (S2-1) (见 Pestic. Man.),

[0507] (5-氯-8-喹啉氧基) 乙酸 1,3-二甲基丁-1-基酯 (S2-2),

[0508] (5-氯-8-喹啉氧基) 乙酸 4-烯丙氧基丁酯 (S2-3),

[0509] (5-氯-8-喹啉氧基) 乙酸 1-烯丙氧基丙-2-基酯 (S2-4),

[0510] (5-氯-8-喹啉氧基) 乙酸乙酯 (S2-5),

[0511] (5-氯-8-喹啉氧基) 乙酸甲酯 (S2-6),

[0512] (5-氯-8-喹啉氧基) 乙酸烯丙酯 (S2-7),

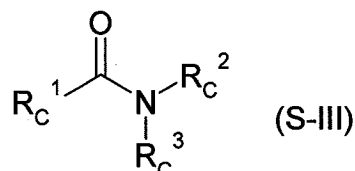
[0513] (5-氯-8-喹啉氧基) 乙酸 2-(2-亚丙基亚胺氧基)-1-乙基酯 (S2-8)、

(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸2-氧丙-1-基酯(S2-9)及相关化合物,如EP-A-86 750、EP-A-94 349和EP-A-191 736或EP-A-0 492 366中所述的;以及它们的水合物和盐,如WO-A-2002/034048中所述的。

[0514] b) (5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸类的化合物,优选化合物例如(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸二乙酯、(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸二烯丙酯、(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸甲乙酯的化合物及相关化合物,如EP-A-0 582 198中所述的。

[0515] C) 式(S-III)化合物

[0516]



[0517] 其中符号和附标具有下述含义:

[0518] R_C^1 为 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_3-C_7) 环烷基,优选为二氯甲基;

[0519] R_C^2 、 R_C^3 相同或不同,为氢、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 炔基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_2-C_4) 卤代烯基、 (C_1-C_4) 烷基氨基甲酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基氨基甲酰基- (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、二氧戊环基- (C_1-C_4) 烷基、噻唑基、咪唑基、咪唑基烷基、噻吩基、哌啶基、被取代的或未被取代的苯基;或者 R_C^2 和 R_C^3 一起形成一个被取代的或未被取代的杂环,

[0520] 优选为噁唑烷环、噻唑烷环、哌啶环、吗啉环、六氢嘧啶环或苯并噁嗪环;

[0521] 优选:

[0522] 经常用作芽前安全剂(土壤作用安全剂)的二氯乙酰胺类活性化合物,例如:

[0523] “烯丙酰草胺(dichlormid)”(见Pestic.Man.)(=N,N-二烯丙基-2,2-二氯乙酰胺),

[0524] “R-29148”(=3-二氯乙酰基-2,2,5-三甲基-1,3-噁唑烷,来自Stauffer),

[0525] “R-28725”(=3-二氯乙酰基-2,2-二甲基-1,3-噁唑烷,来自Stauffer),

[0526] “解草嗪(benoxacor)”(见Pestic.Man.)(=4-二氯乙酰基-3,4-二氢-3-甲基-2H-1,4-苯并噁嗪),

[0527] “PPG-1292”(=N-烯丙基-N-[(1,3-二氧戊环-2-基)甲基]二氯乙酰胺,来自PPG Industries),

[0528] “DKA-24”(=N-烯丙基-N-[(烯丙基氨基羰基)甲基]二氯乙酰胺,来自Sagro-Chem),

[0529] “AD-67”或“MON 4660”(=3-二氯乙酰基-1-氧杂-3-氮杂-螺[4,5]癸烷,来自Nitrokemia或Monsanto),

[0530] “TI-35”(=1-二氯乙酰基氮杂环庚烷,来自TRI-Chemical RT),

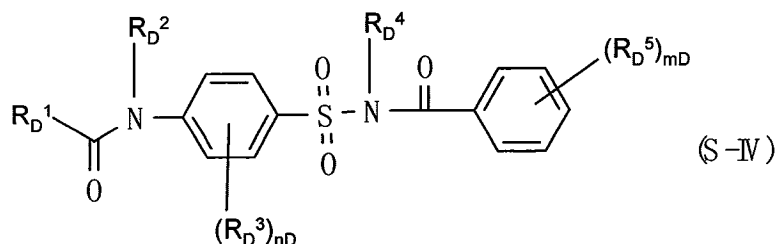
[0531] “diclonon”(dicyclonone)或“BAS145138”或“LAB145138”(=3-二氯乙酰基-2,5,5-三甲基-1,3-二氮杂双环[4.3.0]壬烷,来自BASF),以及

[0532] “解草噁唑(furilazole)”或“MON 13900”(见Pestic.Man.)(=(RS)-3-二氯乙

酰基-5-(2-呋喃基)-2,2-二甲基噁唑烷)。

[0533] D) 式 (S-IV) 的 N-酰基磺酰胺类化合物及其盐,

[0534]



[0535] 其中

[0536] R_D^1 为氢、烃基、烃氧基、烃硫基或杂环基,所述杂环基优选地通过一个碳原子相连,其中最后提及的四种基团各自为未被取代的或者被一个或多个相同或不同的选自以下的基团所取代:卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、羧基、甲酰基、碳酰胺基、磺酰胺基及式 $-Z^a-R^a$ 的基团,

[0537] 其中各个烃部分优选地含有 1 至 20 个碳原子,并且含碳基团 R_D^1 包括取代基在内优选地含有 1 至 30 个碳原子;

[0538] R_D^2 为氢或 (C_1-C_4) -烷基,优选氢,或

[0539] R_D^1 及 R_D^2 与式 $-CO-N-$ 的基团一起为一个 3 至 8 元饱和或不饱和的环的基团;

[0540] R_D^3 相同或不同,并且为卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、羧基、甲酰基、 $CONH_2$ 、 SO_2NH_2 或一个式 $-Z^b-R^b$ 的基团;

[0541] R_D^4 为氢或 (C_1-C_4) -烷基,优选 H;

[0542] R_D^5 相同或不同,并且为卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、羧基、 CHO 、 $CONH_2$ 、 SO_2NH_2 或一个式 $-Z^c-R^c$ 的基团;

[0543] R^a 为烃基或杂环基,其中最后提及的两种基团各自为未被取代的或者被一个或多个相同或不同的选自以下的基团所取代:卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、单及二 [(C_1-C_4) -烷基]氨基、或这样一个烷基,所述烷基中有多个(优选 2 或 3 个)不相邻的 CH_2 基团各自被一个氧原子替代;

[0544] R^b 、 R^c 相同或不同,并且为烃基或杂环基,最后提及的两种基团各自为未被取代的或者被一个或多个相同或不同的选自以下的基团所取代:卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、磷酸基、卤代- (C_1-C_4) -烷氧基、单及二 [(C_1-C_4) -烷基]氨基、或这样一个烷基,所述烷基中含有多个(优选地 2 或 3 个)不相邻的 CH_2 基团各自被一个氧原子替代;

[0545] Z^a 为一个下式的二价基团

[0546] $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-CO-$ 、 $-CS-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-CO-S-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-S-CO-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^*-$ 、 $-CO-NR^*-$ 、 $-NR^*-CO-$ 、 $-SO_2-NR^*$ 或 NR^*-SO_2- , 其中各个二价基团右边所示的键是与基团 R^a 相连的键,并且其中最后提及的五种基团中的 R^* 彼此独立地各自为 H、 (C_1-C_4) -烷基或卤代- (C_1-C_4) -烷基;

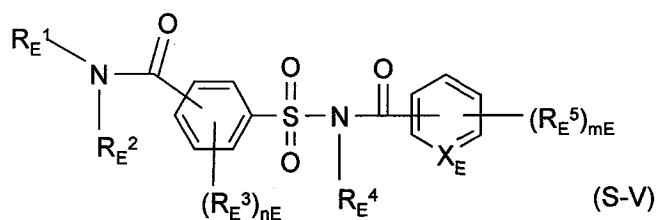
[0547] Z^b 、 Z^c 彼此独立地为一个直接连接的键或一个下式的二价基团: $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-CO-$ 、 $-CS-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-CO-S-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-S-CO-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^*-$ 、 $-SO_2-NR^*-$ 、 $-NR^*-SO_2-$ 、 $-CO-NR^*-$ 或 $-NR^*-CO-$, 其中各个二价基团右边所示的键是与基团 R^b 或 R^c 相连的键,并且其中在最后提及的五种基团中的 R^* 彼此独立地各自为 H、 (C_1-C_4) -烷基或卤代- (C_1-C_4) -烷基;

[0548] n_d 为 0 至 4 中的一个整数, 优选 0、1 或 2、特别是 0 或 1, 并且

[0549] m_d 为 0 至 5 中的一个整数, 优选 0、1、2 或 3、特别是 0、1 或 2。

[0550] E) 通式 (S-V) 的酰基氨磺酰基苯甲酰胺类化合物, 如果合适还有盐形式,

[0551]



[0552] 其中

[0553] X_E 为 CH 或 N;

[0554] R_E^1 为氢、杂环基或烃基, 其中最后提及的两种基团任选地被一个或多个相同或不同的选自以下的基团所取代: 卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、羧基、CHO、CONH₂、SO₂NH₂ 及 Z^a-R^a ;

[0555] R_E^2 为氢、羟基、(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₂-C₆)-烷氧基、(C₂-C₆)-烯氧基, 其中最后提及的五种基团任选地被一个或多个相同或不同的选自以下的基团所取代: 卤素、羟基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-烷氧基及 (C₁-C₄)-烷硫基, 或

[0556] R_E^1 和 R_E^2 及与它们相连的氮原子一起为一个 3 至 8 元饱和或不饱和环;

[0557] R_E^3 为卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、羧基、CHO、CONH₂、SO₂NH₂ 或 Z^b-R^b ;

[0558] R_E^4 为氢、(C₁-C₄)-烷基、(C₂-C₄)-烯基或 (C₂-C₄)-炔基;

[0559] R_E^5 为卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、羧基、磷酰基、CHO、CONH₂、SO₂NH₂ 或 Z^c-R^c ;

[0560] R_a 为一个其碳链被一次或一次以上氧原子间断的 (C₂-C₂₀)-烷基, 为杂环基或烃基, 其中最后提及的两种基团任选地被一个或多个相同或不同的选自以下的基团所取代: 卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、单及二 [(C₁-C₄)-烷基] 氨基;

[0561] R^b 、 R^c 相同或不同, 并且为一个其碳链被一次或一次以上氧原子间断的 (C₂-C₂₀)-烷基, 为杂环基或烃基, 其中最后提及的两种基团任选地被一个或多个相同或不同的选自以下的基团所取代: 卤素、氰基、硝基、氨基、羟基、磷酰基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基、单及二 [(C₁-C₄)-烷基] 氨基;

[0562] Z^a 为一个选自以下的二价部分: O、S、CO、CS、C(O)O、C(O)S、SO、SO₂、NR^d、C(O)NR^d 及 SO₂NR^d;

[0563] Z^b 、 Z^c 相同或不同, 并且为一个直接连接的键或一个选自以下基团的二价部分: O、S、CO、CS、C(O)O、C(O)S、SO、SO₂、NR^d、SO₂NR^d 及 C(O)NR^d;

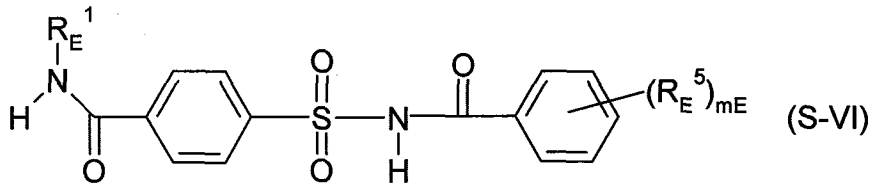
[0564] R^d 为氢、(C₁-C₄)-烷基或 (C₁-C₄)-卤代烷基;

[0565] n_E 为 0 至 4 之间的一个整数, 并且

[0566] m_E 如果 X 为 CH, 则为 0 至 5 之间的一个整数; 并且如果 X 为 N, 则为 0 至 4 之间的一个整数;

[0567] 其中优选的是酰基氨磺酰基苯甲酰胺类化合物 (及其盐形式), 例如下式 (S-VI), 其为已知的, 例如由 WO 99/16744 已知,

[0568]



[0569] 例如以下化合物, 其中

[0570] R_E^1 = 环丙基且 R_E^5 = 2-OMe (“环丙磺酰胺 (cyprosulfamide)”, S3-1),

[0571] R_E^1 = 环丙基且 R_E^5 = 5-Cl-2-OMe (S3-2),

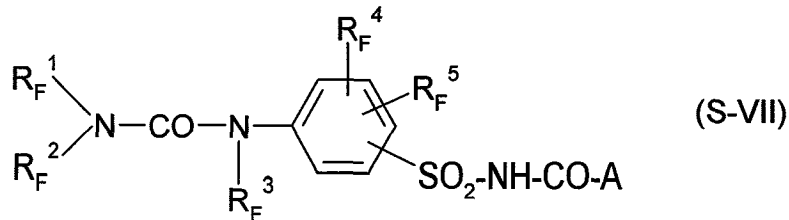
[0572] R_E^1 = 乙基且 R_E^5 = 2-OMe (S3-3),

[0573] R_E^1 = 异丙基且 R_E^5 = 5-Cl-2-OMe (S3-4) 以及

[0574] R_E^1 = 异丙基且 R_E^5 = 2-OMe (S3-5);

[0575] F) 式 (S-VII) 的 N-酰基氨磺酰基苯基脒类化合物, 该化合物可由例如 EP-A-365484 中已知,

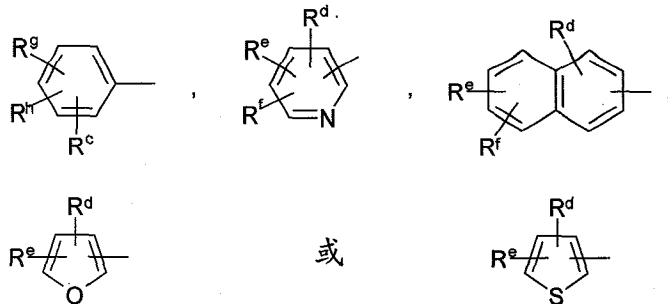
[0576]



[0577] 其中

[0578] A 为一个选自以下的基团

[0579]



[0580] R_F^1 及 R_F^2 彼此独立地为氢、(C₁-C₈)-烷基、(C₃-C₈)-环烷基、(C₃-C₆)-烯基、(C₃-C₆)-炔基,

[0581] 或被 (C₁-C₄)-烷氧基取代的 (C₁-C₄)-烷氧基,

[0582] 或者

[0583] R_F^1 及 R_F^2 一起为 (C₄-C₆)-亚烷基桥基或者被氧、硫、SO、SO₂、NH 或 -N(C₁-C₄-烷基)-所间断的 (C₄-C₆)-亚烷基桥基,

[0584] R_F^3 为氢或 (C_1-C_4) -烷基,

[0585] R_F^4 及 R_F^5 彼此独立地为氢、卤素、氰基、硝基、三氟甲基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷硫基、 C_1-C_4 -烷基亚磺酰基、 C_1-C_4 -烷基磺酰基、 $-COOR^j$ 、 $-CONR^kR^m$ 、 $-COR^n$ 、 $-SO_2NR^kR^m$ 或 $-OSO_2-C_1-C_4$ -烷基, 或者 R^a 与 R^b 一起为可被卤素或 C_1-C_4 -烷基取代的 (C_3-C_4) -亚烷基桥基, 或者为可被卤素或 (C_1-C_4) -烷基取代的 (C_3-C_4) -亚烷基桥基、或可被卤素或 (C_1-C_4) -烷基取代的 C_4 -亚二烯 (alkadienylene) 桥基, 且

[0586] R^g 及 R^h 彼此独立地为氢、卤素、 C_1-C_4 -烷基、三氟甲基、甲氧基、甲硫基或 $-COOR^j$, 其中

[0587] R^c 为氢、卤素、 (C_1-C_4) -烷基或甲氧基,

[0588] R^d 为氢、卤素、硝基、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 (C_1-C_4) -烷基亚磺酰基、 (C_1-C_4) -烷基磺酰基、 $-COOR^j$ 或 $-CONR^kR^m$,

[0589] R^e 为氢、卤素、 C_1-C_4 -烷基、 $-COOR^j$ 、三氟甲基或甲氧基, 或者 R^d 与 R^e 一起为一个 (C_3-C_4) -亚烷基桥基,

[0590] R^f 为氢、卤素或 (C_1-C_4) -烷基,

[0591] R^x 及 R^y 彼此独立地为氢、卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -烷硫基、 $-COOR^j$ 、三氟甲基、硝基或氰基,

[0592] R^j 、 R^k 及 R^m 彼此独立地为氢或 (C_1-C_4) -烷基,

[0593] R^k 及 R^m 一起为一个 (C_4-C_6) -亚烷基桥基或一个被氧、NH 或 $-N(C_1-C_4)$ -烷基)-间断的 C_4-C_6 -亚烷基桥基, 且

[0594] R^n 为 (C_1-C_4) -烷基、苯基或者被卤素、 (C_1-C_4) -烷基、甲氧基、硝基或三氟甲基取代的苯基,

[0595] 其中优选:

[0596] 1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3-甲基脲,

[0597] 1-[4-(N-2-甲氧基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲,

[0598] 1-[4-(N-4,5-二甲基苯甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3-甲基脲,

[0599] 1-[4-(N-萘甲酰基氨基磺酰基)苯基]-3,3-二甲基脲,

[0600] 包括立体异构体及农业上常用的盐,

[0601] G) 羟基芳族化合物和芳族-脂族羧酸衍生物类的活性化合物, 例如:

[0602] 3,4,5-三乙酰氧基苯甲酸乙酯、3,5-二甲氧基-4-羟基苯甲酸、3,5-二羟基苯甲酸、4-羟基水杨酸、4-氟水杨酸、1,2-二氢-2-氧代-6-三氟甲基吡啶-3-甲酰胺、2-羟基肉桂酸、2,4-二氯肉桂酸, 如 W02004084631、W0 2005015994、W0 2006007981、W0 2005016001 中所述的;

[0603] H) 1,2-二氢喹啉-2-酮类的活性化合物, 例如:

[0604] 1-甲基-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹啉-2-酮、1-甲基-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹啉-2-硫酮、1-(2-氨基乙基)-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹啉-2-酮盐酸盐、1-(2-甲基磺酰基氨基乙基)-3-(2-噻吩基)-1,2-二氢喹啉-2-酮, 如 W0 2005112630 中所述的,

[0605] I) 不仅对有害植物具有除草作用、同时还对作物植物(例如稻)具有安全剂作用的活性化合物, 例如:

[0606] “哌草丹”或“MY-93”(见 Pestic. Man.) (= 哌啶 1- 硫代羧酸 S-1- 甲基 -1- 苯基乙酯), 其作为抵抗除草剂禾草敌损害的稻安全剂已知,

[0607] “杀草隆”或“SK 23”(见 Pestic. Man.) (= 1-(1- 甲基 -1- 苯基乙基)-3- 对甲苯基脲), 其作为抵抗除草剂唑吡啶磺隆损害的稻安全剂已知,

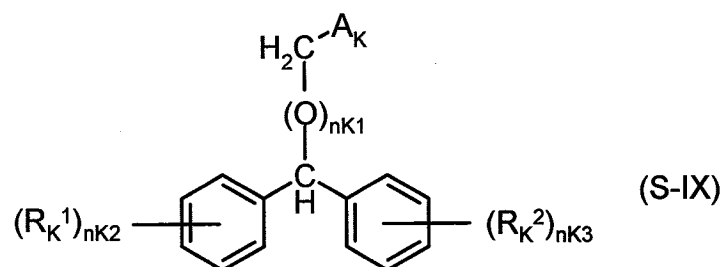
[0608] “苻草隆”或“JC-940”(= 3-(2- 氯苯基甲基)-1-(1- 甲基 -1- 苯基乙基) 脲, 见 JP-A-60087254), 其作为抵抗多种除草剂损害的稻安全剂已知,

[0609] “苯草酮”或“NK 049”(= 3,3'- 二甲基 -4- 甲氧基二苯甲酮), 其作为抵抗多种除草剂损害的稻安全剂已知,

[0610] “CSB”(= 1- 溴 -4-(氯甲基磺酰基) 苯) (CAS 注册号 : 54091-06-4, 来自 Kumiai), 其作为抵抗多种除草剂损害的稻安全剂已知,

[0611] K) 式 (S-IX) 的化合物, 如 WO-A-1998/38856 中所述的,

[0612]



[0613] 其中符号和附标具有下述含义 :

[0614] R_K^1 、 R_K^2 彼此独立地为卤素、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 烷基氨基、二 (C_1-C_4) 烷基氨基、硝基 ;

[0615] A_K 为 $COOR_K^3$ 或 $COOR_K^4$

[0616] R_K^3 、 R_K^4 彼此独立地为氢、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_4) 炔基、氰基烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、苯基、硝基苯基、苯甲基、卤代苯甲基、吡啶基烷基或烷基铵,

[0617] n_K^1 为 0 或 1,

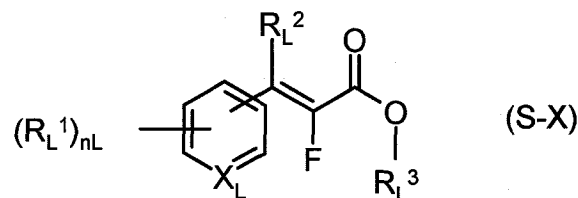
[0618] n_K^2 、 n_K^3 彼此独立地为 0、1 或 2,

[0619] 优选 :

[0620] (二苯基甲氧基) 乙酸甲酯 (CAS 注册号 : 41858-19-9),

[0621] L) 式 (S-X) 的化合物, 如 WO A-98/27049 中所述的,

[0622]



[0623] 其中符号和附标具有下述含义 :

[0624] X_L 为 CH 或 N,

[0625] n_L 当 $X = N$ 时, 为 0 至 4 的一个整数 ; 当 $X = CH$ 时, 为 0 至 5 的一个整数 ;

[0626] R_L^1 为卤素、 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 卤代烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 卤代烷氧基、硝基、 (C_1-C_4) 烷基磺基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基、 (C_1-C_4) 烷氧基羰基、任选取代的苯基、任选取代

的苯氧基，

[0627] R_L^2 为氢或 (C_1-C_4) 烷基，

[0628] R_L^3 为氢、 (C_1-C_8) 烷基、 (C_2-C_4) 烯基、 (C_2-C_4) 炔基或芳基，其中上述每一个含碳基团为未被取代的或者被一个或多个（优选地最多 3 个）选自卤素和烷氧基的相同或不同基团所取代；或其盐。

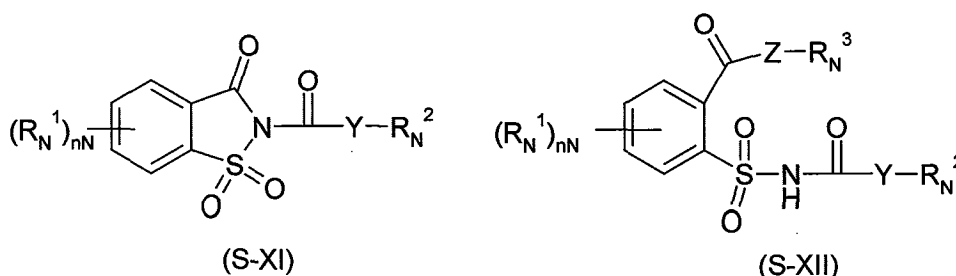
[0629] M) 3-(5-四唑基羰基)-2-喹诺酮类的活性化合物，例如：

[0630] 1,2-二氢-4-羟基-1-乙基-3-(5-四唑基羰基)-2-喹诺酮 (CAS 注册号：219479-18-2)、1,2-二氢-4-羟基-1-甲基-3-(5-四唑基羰基)-2-喹诺酮 (CAS 注册号：95855-00-8)，如 WO-A-1999000020 中所述的，

[0631] N) 式 (S-XI) 或 (S-XII) 的化合物，如 WO-A-2007023719 和 WO-A-2007023764 中所

述的，

[0632]



[0633] 其中

[0634] R_N^1 为卤素、 (C_1-C_4) 烷基、甲氧基、硝基、氰基、 CF_3 、 OCF_3 ，

[0635] Y、Z 彼此独立地为 O 或 S，

[0636] n_N 为 0 至 4 中的一个整数，

[0637] R_N^2 为 (C_1-C_{16}) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_3-C_6) 环烷基、芳基、苯甲基、卤代苯甲基，

[0638] R_N^3 为氢、 (C_1-C_6) 烷基，

[0639] O) 一种或多种选自以下的化合物：

[0640] 1,8-萘二甲酸酐，

[0641] S-2-乙硫基乙基二硫代磷酸 0,0-二乙酯（乙拌磷 (disulfoton)），

[0642] 甲基氨基甲酸 4-氯苯基酯 (mephenate)，

[0643] 0-苯基硫代磷酸 0,0-二乙酯（增效磷 (dietholate)），

[0644] 4-羧基-3,4-二氢-2H-1-苯并吡喃-4-乙酸 (CL-304415, CAS 注册号：31541-57-8)，

[0645] 1-氧杂-4-氮杂螺[4.5]癸烷-4-二硫代羧酸 2-丙烯酸酯 (MG-838, CAS 注册号：133993-74-5)，

[0646] [(3-氧代-1H-2-苯并噻喃-4(3H)-亚基)甲氧基]乙酸甲酯（已知于 WO-A-98/13361；CAS 注册号：205121-04-6），

[0647] 氰基甲氧基亚氨基（苯基）乙腈（解草胺腈 (cyometrinil)），

[0648] 1,3-二氧戊环-2-基甲氧基亚氨基（苯基）乙腈（解草腈 (oxabetrinil)），

[0649] 4'-氯-2,2,2-三氟乙酰苯酮 0-1,3-二氧戊环-2-基甲基脒（氟草脒 (fluxofenim)），

[0650] 4,6-二氯-2-苯基嘧啶(解草啶(fenclozim)),

[0651] 2-氯-4-三氟甲基-1,3-噻唑-5-羧酸苯甲酯(解草胺(flurazole)),

[0652] 2-二氯甲基-2-甲基-1,3-二氧戊环(MG-191),

[0653] 包括立体异构体,以及农业中常用的盐。

[0654] 除草剂(混合物)与安全剂的重量比通常取决于所述除草剂施用率和所述安全剂的效力,并可在较宽范围内变化,例如其范围为200:1至1:200、优选地为100:1至1:100、特别是20:1至1:20。所述安全剂可类似于式(I)化合物制成制剂或与其他除草剂/杀虫剂的混合物一起制成制剂,并以最终制剂或桶混物的形式与除草剂一起提供并使用。

[0655] 使用时,以市售可得形式存在的除草剂或除草剂/安全剂制剂,如果合适,以常规方式稀释;例如对于可湿性粉剂、乳油、分散剂和水分散性颗粒剂的情况下使用水。粉剂、土壤用或撒播用颗粒剂和可喷雾溶液剂形式的制剂通常无需在使用前用另外的惰性物质进一步稀释。

[0656] 式(I)的化合物和/或其盐的所需施用率随例如外部条件——如温度、湿度及所用除草剂类型——而变化。其可在很宽的范围内变化。对于用于防治有害植物的除草剂,其施用率为例如,0.001至10.0kg/ha或更多的活性物质、优选0.005至5kg/ha、特别是0.01至1kg/ha的范围内的活性物质。这既适用于芽前施用也适用于芽后施用。

[0657] 当作为植物生长调节剂使用时,例如作为茎秆稳定剂(culm stabilizer)用于上述作物植物、优选谷类植物(例如大麦、小麦、黑麦、黑小麦、粟、稻或玉米)时,所述施用率为,例如在0.001至2kg/ha的范围内或更多的活性物质、优选地在0.005至1kg/ha、特别是在10至500g/ha活性物质的范围内,非常特别地20至250g/ha活性物质。这既适用于芽前法施用也适用于芽后法施用,通常优选芽后处理。

[0658] 作为茎秆稳定剂的施用可在植物生长中多阶段进行。优选地,例如,在分蘖阶段之后、在纵向生长之初施用。

[0659] 或者,也可通过处理种子来施用植物生长调节剂,所述处理包括多种拌种和包种技术。在此,所述施用率取决于具体技术,并可在初步试验中进行确定。

[0660] 以示例的方式,通式(I)化合物的一些合成实施例描述如下。

[0661] 在实施例中,除非另外特别指明,否则所述的量(包括百分率)皆指是重量。如果在本说明书及实施例中术语“R”及“S”表示在式(I)的立体异构体的手性中心上的绝对构型,则除非不同地定义该RS命名法遵循Cahn-Ingold-Prelog规则。

[0662] (A) 合成实施例

[0663] 实施例A1[5-(4-氯苯基)-3-甲基-1H-吡唑-4-基]乙酸甲酯(见表2,实例2-28)

[0664] a) [5-(4-氯苯基)-3-甲基-1H-吡唑-4-基]乙酸甲酯的制备

[0665] 将2.236g(45mmol)的水合肼加入至10g(37mmol)3-[(4-氯苯基)羰基]-4-氧代戊酸甲酯的乙醇(100ml)溶液中。将该混合物加热回流6小时,然后将其加到水中并用二氯甲烷萃取。将合并的有机相经硫酸镁干燥、过滤并浓缩。这样得到6.9g产物(理论值的63%)。

[0666] NMR(CDC₁₃,400MHz):2.28(s,3H);3.5(s,2H);3.7(s,3H);7.39(d,2H);7.5(d,

2H)。

[0667] b) [5-(4-氯苯基)-3-甲基-1-(咪啉-5-基)-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯的制备

[0668] 将 0.287g (2mmol) 氟化铯、0.103g (1mmol) 乙酸铜 (II) 以及 0.212g (2mmol) 叔丁醇钾加入至 10ml 二氯甲烷中的 0.5g (2mmol) [5-(4-氯苯基)-3-甲基-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯中。然后加入 0.234g (2mmol) 的 5-咪啉基硼酸, 将该混合物于 20°C 下搅拌 45 小时。然后将该混合物加入到饱和氯化铵溶液 (10ml) 中并用二氯甲烷萃取。将合并的有机相经硫酸镁干燥、过滤并浓缩。将粗产物用制备型 HPLC 纯化。这样得到 0.040g 产物 (理论值的 5.8%)。

[0669] NMR (CDCl₃, 400MHz) : 2.36 (s, 3H) ; 3.4 (s, 2H) ; 3.71 (s, 3H) ; 7.2 (d, 2H) ; 7.41 (d, 2H) ; 8.53 (s, 2H) ; 9.05 (s, 1H)。

[0670] 实施例 A2 [5-(4-氯苯基)-1-(2-氯代咪啉-5-基)-3-甲基-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯 (见表 2, 实例 2-29)

[0671] 将 0.515g (3mmol) 乙酸铜 (II) 及 0.306ml (4mmol) 吡啶加入至 10ml 二氯甲烷中的 0.5g (2mmol) [5-(4-氯苯基)-3-甲基-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯中。然后加入 0.598g (4mmol) 2-氯代咪啉-5-硼酸并将该混合物于 20°C 下搅拌 24h。然后将该混合物加入至 1M HCl 中, 并用二氯甲烷萃取。将合并的有机相经硫酸镁干燥、过滤并浓缩。将粗产物用制备型 HPLC 纯化。这样得到 0.015g 产物 (理论值的 2%)。

[0672] NMR (CDCl₃, 400MHz) : 2.34 (s, 3H) ; 3.39 (s, 2H) ; 3.71 (s, 3H) ; 7.2 (d, 2H) ; 7.45 (d, 2H) ; 8.52 (s, 2H)。

[0673] 实施例 A3 [3-甲基-5-苯基-1-(吡啶-2-基)-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯 (见表 11, 实例 11-2)

[0674] 将 12.5ml 乙醇中的 0.378g (3.330mmol) 的 3-胍基吡啶加入至 0.600g (2.561mmol) 4-氧-3-(苯基羰基)戊酸甲酯中, 并将该混合物在密封容器中于微波炉中 135°C 加热 1.5h。减压移除溶剂, 并将残余物溶解在二氯甲烷中且用水洗涤两次, 每次 25ml。将合并的有机相经硫酸钠干燥, 并减压移除溶剂。对该残余物进行色谱分离, 得到 0.115g (理论值的 13.8%) 的浅黄色蜡状物。

[0675] NMR (CDCl₃, 300MHz) : 2.39 (s, 3H) ; 3.40 (s, 2H) ; 3.69 (s, 3H) ; 7.23 (m, 2H) ; 7.39 (m, 3H) ; 8.22 (dd, 1H) ; 8.38 (dd, 1H) ; 8.66 (d, 1H)。

[0676] 实施例 A4 [3-甲基-5-苯基-1-(吡啶-2-基)-1H-吡啶-4-基]乙酸 (见表 10, 实例 10-2)

[0677] 将 0.073g (1.819mmol) 的 2 摩尔浓度 (molar) 氢氧化钠水溶液加入至溶于 5ml 甲醇中的 0.165g (0.455mmol) [3-甲基-5-苯基-1-(吡啶-2-基)-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯 (见 A3) 中, 并将该混合物在 20°C 下搅拌 1h。减压移除甲醇并将残余物倒入 10ml 水及 15ml 二氯甲烷的混合物中。将水相用 15ml 二氯甲烷萃取、用浓盐酸 (pH = 3) 酸化并用二氯甲烷萃取三次, 每次 15ml。将合并的有机相干燥并减压移除溶剂, 得到 0.080g (理论值的 59.7%) 的无色泡沫状 (foamy) 固体, 熔点为 125°C。

[0678] NMR (CDCl₃, 300MHz) : 2.4 (s, 3H) ; 3.42 (s, 2H) ; 7.25 (m, 2H) ; 7.39 (m, 3H) ; 8.22 (dd, 1H) ; 8.39 (dd, 1H) ; 8.70 (d, 1H) ; 8.97 (br s, 1H)。

[0679] 实施例 A5 [1-(6-氯代咪啉-3-基)-3-甲基-5-苯基-1H-吡啶-4-基]乙酸甲

酯（见表 5, 实例 5-7）

[0680] a) [1-(6-氯代哒嗪-3-基)-5-羟基-3-甲基-5-苯基-4,5-二氢-1H-吡唑-4-基] 乙酸甲酯的制备

[0681] 将 5.00ml 乙醇中的 0.296g(2.049mmol)3-氯-6-胍基哒嗪加入至 0.400g(1.708mmol)4-氧代-3-(苯基羰基)戊酸甲酯中,并将该混合物回流下搅拌 8h。减压移除溶剂,在色谱分离残余物之后,得到 0.300g(理论值的 48%)的粘稠的黄色油状物。

[0682] NMR(CDCl₃, 300MHz) :1.94(s, 3H) ;2.81(dd, 1H) ;3.12(dd, 1H) ;3.67(s, 3H) ;4.91(dd, 1H) ;7.34(d, 1H) ;7.41(d, 1H) ;7.45(m, 2H) ;7.59(m, 1H) ;8.01(d, 1H) ;8.03(d, 1H)。

[0683] b) [1-(6-氯代哒嗪-3-基)-3-甲基-5-苯基-1H-吡唑-4-基] 乙酸甲酯的制备

[0684] 将 0.111g(2.772mmol) 的 2 摩尔浓度氢氧化钠水溶液加入至 8ml 甲醇中的 0.200g(0.554mmol) [1-(6-氯代哒嗪-3-基)-5-羟基-3-甲基-5-苯基-4,5-二氢-1H-吡唑-4-基] 乙酸甲酯中,并将该混合物于 20℃下搅拌 1h。减压移除甲醇,并将残余物倒入 10ml 水和 15ml 二氯甲烷的混合物中。将水相用 15ml 二氯甲烷萃取、用浓盐酸 (pH = 3) 酸化并用二氯甲烷萃取三次,每次 15ml。将合并的有机相干燥并减压移除溶剂,得到 0.207g(理论值的 99%) 的棕色蜡状固体,熔点为 55℃。

[0685] NMR(CDCl₃, 300MHz) :2.39(s, 3H) ;3.42(s, 2H) ;4.3(s, 3H) ;6.9(d, 1H) ;7.28(m, 2H) ;7.37(m, 3H) ;7.63(d, 1H)。

[0686] 实施例 A6 [1-(6-氯代哒嗪-3-基)-3-甲基-5-苯基-1H-吡唑-4-基] 乙酸（见表 4, 实例 4-7）

[0687] 将 0.058g(1.444mmol) 的 2 摩尔浓度氢氧化钠水溶液加入至 5.00ml 甲醇中的 0.099g(0.289mmol) [1-(6-氯代哒嗪-3-基)-3-甲基-5-苯基-1H-吡唑-4-基] 乙酸甲酯中,并将该混合物于 20℃下搅拌 1h。减压移除甲醇,并将残余物倒入 10ml 水及 15ml 二氯甲烷的混合物中。将水相用 15ml 二氯甲烷萃取、用浓盐酸 (pH = 3) 酸化并用二氯甲烷萃取三次,每次 15ml。将合并的有机相干燥并减压移除溶剂,得到 0.052g(理论值的 54.7%) 的棕色蜡状固体。

[0688] NMR(CDCl₃, 300MHz) :2.36(s, 3H) ;3.40(s, 2H) ;7.28(m, 2H) ;7.37(m, 3H) ;7.51(d, 1H) ;7.87(br d, 1H)。

[0689] 实施例 A73-[(4-氯苯基) 羰基]-4-氧代戊酸甲酯（见表 13, 实例 13-13）

[0690] 将溶于二甲亚砜的 10g(51mmol) 1-(4-氯代苯基) 丁-1,3-二酮（市售可得）慢慢逐滴加入至 200ml 二甲亚砜中的 2.237g(56mmol) 氢化钠中,从而使温度不超过 30℃。将该混合物于 20℃下再搅拌 30 分钟。然后于 0℃下缓慢滴加少量二甲亚砜中的 8.558g(56mmol) 的溴代乙酸甲酯。将该混合物于 20℃下搅拌 4 小时。将该混合物倒入冰水中,并用二氯甲烷萃取。将有机相反复用水洗涤。将合并的有机相干燥,减压下移除溶剂,并色谱分离残余物,生成 7.750g 的产物（理论值的 56.7%）。

[0691] NMR(CDCl₃, 400MHz) :2.19(s, 3H) ;2.99(d, 1H) ;3.03(d, 1H) ;3.69(s, 3H) ;4.95(dd, 1H) ;7.49(d, 2H) ;7.98(d, 2H)。

[0692] 实施例 A84-氧代-3-(吡啶-2-基羰基) 戊酸甲酯（见表 13, 实例 13-68）

[0693] a) 1-(吡啶-2-基) 丁-1,3-二酮的制备

[0694] 将甲醇钠(28%于甲醇中)溶液滴加至10g(73mmol)吡啶甲酸甲酯和25ml(124mmol)丙酮于150ml四氢呋喃中的混合物中。将该混合物于20℃下搅拌3小时并减压移除溶剂。将残余物溶解在水中、用2摩尔浓度盐酸水溶液酸化并用二氯甲烷萃取。将合并的有机相干燥并减压移除溶剂,得到7.940g产物(理论值的60%)。

[0695] NMR(CDCl₃, 400MHz): 2.23(s, 3H); 6.81(s, 1H); 7.41(m, 1H); 7.83(m, 1H); 8.09(m, 1H); 8.68(m, 1H); 15.7(br, 1H)。

[0696] b)

[0697] 将溶于二甲基亚砜中3.38g(20.7mmol)1-(吡啶-2-基)丁-1,3-二酮的溶液缓慢滴加至25ml二甲亚砜中的0.911g(22.78mmol)氢化钠中,以使温度不超过30℃。将该混合物于20℃下再搅拌30分钟。然后于0℃下缓慢滴加少量二甲亚砜中的3.486g(22.78mmol)的溴代乙酸甲酯。将该混合物于20℃下再搅拌4小时。将反应混合物倒入冰水中,并用二氯甲烷萃取。将有机相用水反复洗涤。将合并的有机相干燥,减压移除溶剂,并色谱分离剩余物,得到3.48g产物(理论值的71.4%)。

[0698] NMR(CDCl₃, 400MHz): 2.4(s, 3H); 2.9(d, 1H); 3.05(d, 1H); 3.69(s, 3H); 5.49(dd, 1H); 7.50(m, 1H); 7.86(m, 1H); 8.07(m, 1H); 8.7(m, 1H)。

[0699] 实施例A9[3-甲基-5-(吡啶-2-基)-1H-吡啶-5-基]-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯(见表2,实例2-116)

[0700] a) [3-甲基-5-(吡啶-2-基)-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯的制备

[0701] 将1.170g(23mmol)的水合肼加入至5g(21mmol)的4-氧代-3-(吡啶-2-基羰基)戊酸甲酯的乙醇(50ml)溶液中。将该混合物加热回流下搅拌7小时,加到水中并用乙酸乙酯萃取。将合并的有机相经硫酸镁干燥、过滤并浓缩。这样得到2.290g产物(理论值的41.9%)。

[0702] NMR(CDCl₃, 400MHz): 2.3(s, 3H); 3.84(s, 2H); 7.19(m, 1H); 7.72(m, 1H); 7.84(m, 1H); 8.59(m, 1H)。

[0703] b)

[0704] 将1.767g(9.73mmol)乙酸铜(II)及1.049ml(12.973mmol)吡啶加入至20ml二氯甲烷中的1.5g(6.486mmol)[3-甲基-5-(吡啶-2-基)-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯中。然后加入1.607g(12.973mmol)5-吡啶基硼酸,并将该混合物于20℃下搅拌48h。将该混合物倒入1摩尔浓度HCl水溶液(10mL)中,并用二氯甲烷萃取。将合并的有机相经硫酸镁干燥、过滤并浓缩。将粗产物用制备型HPLC纯化。这样得到酯和酸的混合物,将该混合物在含有1滴硫酸的甲醇中加热回流4小时。将该反应混合物倒入水(20ml)中、中和并用二氯甲烷萃取。将合并的有机相经硫酸镁干燥并浓缩。这样得到0.031g产物(理论值的1.47%)。

[0705] NMR(CDCl₃, 400MHz): 2.38(s, 3H); 3.57(s, 2H); 3.71(s, 3H); 7.32(m, 1H); 7.46(m, 1H); 7.79(m, 1H); 8.61(m, 1H); 8.63(s, 2H); 9.04(s, 1H)。

[0706] 以下表1至12中所述化合物根据上述方法或类似方法获得。

[0707] 表13列出了式(III)的中间体,其可根据上述方法使用。

[0708] 在表1至13中:

[0709] F、Cl、Br、I = 根据原子的常规化学符号,分别为氟、氯、溴和碘

[0710] Me = 甲基

- [0711] MeO 或 OMe = 甲氧基
 [0712] 3,5-Me₂ = 3,5- 二甲基 (例如作为苯环上的取代基)
 [0713] 4,5-Cl₂ = 4,5- 二氯 (例如作为苯环上的取代基)
 [0714] Et = 乙基
 [0715] Pr = nPr = 正丙基
 [0716] iPr = 异丙基
 [0717] iOPr = 0-iPr = iPrO = 异丙氧基
 [0718] cyPr = 环丙基
 [0719] Bu = nBu = 正丁基 = 丁 -1- 基
 [0720] iBu = 异丁基 = 2- 甲基丙 -1- 基
 [0721] sBu = sec-Bu
 [0722] tBu = t- 丁基 = 叔丁基 = 2- 甲基丙 -2- 基
 [0723] Ph = 苯基
 [0724] PhO = 苯氧基
 [0725] Ac = COCH₃ = 乙酰基
 [0726] 烯丙基 = 丙 -2- 烯 -1- 基
 [0727] COOH = 羧基
 [0728] OSO₂Me = -O-S(=O)₂-CH₃, 甲基磺酰氧基, 甲磺酰酯基
 [0729] “(R⁶)_n = H” = 未取代的环 (n = 0)

[0730] 此外, 常规化学符号也适用, 例如 CH₂ 表示亚甲基或 CF₃ 表示三氟甲基或 OH 表示羟基。相应地, 组合含义根据上述缩写的组成来定义。

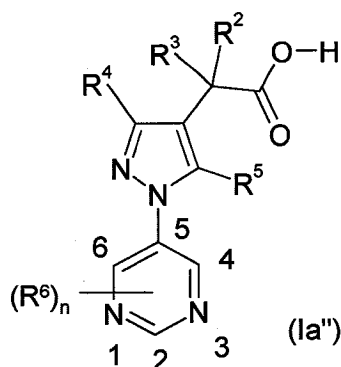
[0731] 表中化合物的物理数据 (“数据”), 如果合适, 在具体制备实施例中 (见上) 或表尾示出。在此:

[0732] “NMR” = ¹H-NMR 谱的数据 (¹H 核磁共振数据)

[0733] “m. p.” = 熔点

[0734] 表 1 : 式 (Ia”) 的化合物

[0735]



[0736]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
1-1	H	H	Ph	Ph	H
1-2	H	H	Me	Ph	H
1-3	H	H	Me	5-I-2- 噻吩基	H

1-4	H	H	Me	2- 呋喃基	H
1-5	H	H	Me	Ph	2-OMe
1-6	Me	H	Me	Ph	4-Me
1-7	H	H	Me	Ph	2-Cl
1-8	H	H	Me	Ph	4-CF ₃
1-9	H	H	Me	Ph	2-CF ₃
1-10	H	H	Me	Ph	4-Me
1-11	H	H	Me	Ph	2, 4-Me ₂
1-12	H	H	Me	Ph	2, 4-Cl ₂
1-13	H	H	Me	4-MeO-Ph	4-Me
1-14	H	H	Me	4-MeO-Ph	H
1-15	Me	H	Me	Ph	H
1-16	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
1-17	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Cl
1-18	H	H	Me	4-Me-Ph	H
1-19	H	H	Me	3-Cl-Ph	H
1-20	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	H
1-21	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	4-Me
1-22	H	H	Me	3, 4-Cl ₂ -Ph	4-Me
1-23	H	H	Me	3-Cl-Ph	4-Me
1-24	H	H	Me	2-Cl-Ph	4-Me
1-25	H	H	Me	2, 4-Cl ₂ -Ph	4-Me
1-26	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	4-Me
1-27	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Me
1-28	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
1-29	H	H	Me	3, 4-Cl ₂ -Ph	H
1-30	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	H

[0737]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
1-31	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Cl
1-32	H	H	Me	Ph	4-Cl
1-33	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
1-34	H	H	Me	4-tBu-Ph	4-Me
1-35	H	H	Me	3, 5-Me ₂ -Ph	4-Me
1-36	H	H	Me	Ph	4-OMe
1-37	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-OMe
1-38	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
1-39	H	H	Me	4-F-Ph	4-Cl
1-40	H	H	Me	4-F-Ph	4-Me
1-41	H	H	Me	3-Me-Ph	4-Me
1-42	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	4-Me
1-43	H	H	Me	3-Br-Ph	4-Me
1-44	H	H	Me	4-Ph-Ph	4-Me
1-45	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	H
1-46	H	H	Me	3, 5-Me ₂ -Ph	H
1-47	H	H	Me	Ph	4-SMe
1-48	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SMe
1-49	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H
1-50	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	H
1-51	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	4-Me
1-52	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	4-Me
1-53	H	H	Me	2- 吡啶基	4-Cl

1-54	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-F
1-55	H	H	Me	2- 噻吩基	4-Me
1-56	H	H	Me	3-Me-2- 噻吩基	4-Me
1-57	H	H	Me	4-Me-2- 噻吩基	4-Me
1-58	H	H	Me	5-Cl-2- 噻吩基	4-Me
1-59	H	H	Me	5-Cl-2- 噻吩基	4-Cl
1-60	H	H	Me	3- 噻吩基	4-Me
1-61	H	H	Me	2- 噻吩基	H
1-62	H	H	Me	3-Me-2- 噻吩基	H
1-63	H	H	Me	4-Me-2- 噻吩基	H
1-64	H	H	Me	5-Cl-2- 噻吩基	H
1-65	H	H	Me	5-Me-2- 噻吩基	H
1-66	H	H	Me	6-MeO- 吡啶 -3- 基	H
1-67	H	H	Me	5-Br-2- 噻吩基	H
1-68	H	H	Me	5-Br-2- 噻吩基	4-Me
1-69	H	H	Me	3- 噻吩基	H

[0738]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
1-70	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-S(O)Me
1-71	H	H	Me	4-Br-Ph	4-Me
1-72	H	H	Me	1,3- 苯并二氧杂环戊烯 -5- 基	4-Me
1-73	H	H	Me	4-I-Ph	4-Me
1-74	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	4-Me
1-75	H	H	Me	4-PhO-Ph	4-Me
1-76	H	H	Me	6-OH- 吡啶 -3- 基	H
1-77	H	H	Me	Ph	4-S(O)Me
1-78	H	H	H	Ph	H
1-79	H	H	H	Ph	4-Me
1-80	H	H	Et	Ph	H
1-81	H	H	n-Pr	Ph	H
1-82	H	H	CH ₂ Cl	Ph	H
1-83	H	H	CHCl ₂	Ph	H
1-84	H	H	CH ₂ F	Ph	H
1-85	H	H	CHF ₂	Ph	H
1-86	H	H	Cl	Ph	H
1-87	H	H	Et	Ph	4-Me
1-88	H	H	n-Pr	Ph	4-Me
1-89	H	H	CH ₂ Cl	Ph	4-Me
1-90	H	H	CHCl ₂	Ph	4-Me
1-91	H	H	CH ₂ F	Ph	4-Me
1-92	H	H	CHF ₂	Ph	4-Me
1-93	H	H	Cl	Ph	4-Me
1-94	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
1-95	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
1-96	H	H	CH ₂ Cl	4-Cl-Ph	H
1-97	H	H	CHCl ₂	4-Cl-Ph	H
1-98	H	H	CH ₂ F	4-Cl-Ph	H
1-99	H	H	CHF ₂	4-Cl-Ph	H
1-100	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
1-101	H	H	Et	4-Me-Ph	H
1-102	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H
1-103	H	H	CH ₂ Cl	4-Me-Ph	H

1-104	H	H	CHCl ₂	4-Me-Ph	H
1-105	H	H	CH ₂ F	4-Me-Ph	H
1-106	H	H	CHF ₂	4-Me-Ph	H
1-107	H	H	Cl	4-Me-Ph	H
1-108	H	H	Et	2-吡啶基	H

[0739]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
1-109	H	H	n-Pr	2-吡啶基	H
1-110	H	H	CH ₂ Cl	2-吡啶基	H
1-111	H	H	CHCl ₂	2-吡啶基	H
1-112	H	H	CH ₂ F	2-吡啶基	H
1-113	H	H	CHF ₂	2-吡啶基	H
1-114	H	H	Cl	2-吡啶基	H
1-115	H	H	Me	2-吡啶基	H
1-116	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
1-117	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Cl
1-118	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Me
1-119	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
1-120	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Cl
1-121	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Me
1-122	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
1-123	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
1-124	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	4-Me
1-125	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	H
1-126	H	H	Me	4-CH ₂ COOH-Ph	4-Me
1-127	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	4-Me
1-128	H	H	Me	4-Br-Ph	H
1-129	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	H
1-130	H	H	Me	3-Me-Ph	H
1-131	H	H	Me	4-F-Ph	H
1-132	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
1-133	H	H	Me	4-tBu-Ph	H
1-134	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
1-135	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	4-Me
1-136	H	H	Me	3-吡啶基	H
1-137	H	H	Me	4-吡啶基	H
1-138	H	H	C(O)OMe	Ph	H
1-139	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
1-140	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SO ₂ Me
1-141	H	H	Me	3-吡啶基	4-Me
1-142	H	H	Me	2,3-Cl ₂ -Ph	4-Me
1-143	H	H	Me	2-吡啶基	4-Me
1-144	H	H	H	4-Cl-Ph	4-Me
1-145	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
1-146	H	H	Me	Ph	2-Me
1-147	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H

[0740]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
1-148	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Me
1-149	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Cl
1-150	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-F

1-151	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H
1-152	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H
1-153	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
1-154	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
1-155	H	H	Me	5-CF ₃ -吡啶-2-基	H
1-156	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
1-157	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
1-158	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
1-159	H	H	CN	4-Cl-Ph	4-Me
1-160	H	H	CN	4-Me-Ph	H
1-161	H	H	CN	4-Me-Ph	4-Me
1-162	H	H	CN	Ph	H
1-163	H	H	CN	Ph	4-Me
1-164	H	H	CN	2-吡啶基	H
1-165	H	H	CN	3-吡啶基	H
1-166	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H
1-167	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H
1-168	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
1-169	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H
1-170	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
1-171	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
1-172	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
1-173	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
1-174	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
1-175	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
1-176	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	H
1-177	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	4-Me
1-178	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	H
1-179	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	4-Me
1-180	H	H	甲酰基	Ph	H
1-181	H	H	甲酰基	Ph	4-Me
1-182	H	H	甲酰基	2-吡啶基	H
1-183	H	H	甲酰基	3-吡啶基	H
1-184	H	H	甲酰基	5-Cl-吡啶-2-基	H
1-185	H	H	甲酰基	5-Br-吡啶-2-基	H
1-186	H	H	甲酰基	5-F-吡啶-2-基	H

[0741]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
1-187	H	H	甲酰基	5-Me-吡啶-2-基	H
1-188	H	H	甲酰基	6-Me-吡啶-3-基	H
1-189	H	H	甲酰基	4-Me-吡啶-2-基	H
1-190	H	H	甲酰基	4-F-吡啶-2-基	H
1-191	H	H	甲酰基	4-Cl-吡啶-2-基	H
1-192	H	H	甲酰基	4-Br-吡啶-2-基	H
1-193	H	H	甲酰基	4-OMe-吡啶-2-基	H
1-194	H	H	CH ₂ OH	5-Me-吡啶-2-基	H
1-195	H	H	CH ₂ OH	4-Cl-Ph	H
1-196	H	H	CH ₂ OH	4-Me-吡啶-2-基	H
1-197	H	H	CH ₂ OH	4-Me-Ph	H
1-198	H	H	CH ₂ OH	Ph	H
1-199	H	H	CH ₂ OH	2-吡啶基	H
1-200	H	H	Me	2-噻唑基	H

1-201	H	H	Me	2-噻唑基	4-Cl
1-202	H	H	Me	2-噻唑基	4-Me
1-203	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
1-204	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Cl
1-205	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Me
1-206	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
1-207	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
1-208	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	4-Me
1-209	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
1-210	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	H
1-211	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	4-Me
1-212	H	H	Me	2-吡啶基	4-F
1-213	H	H	Me	2-吡啶基	H
1-214	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
1-215	H	H	Me	2-吡啶基	4-Me
1-216	H	H	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H
1-217	H	H	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	4-Me
1-218	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
1-219	H	H	Me	1,5-Me ₂ -吡啶-3-基	H
1-220	H	H	Me	1,5-Me ₂ -吡啶-3-基	4-Me
1-221	H	H	Me	4,5-Me ₂ -噻唑-2-基	H
1-222	H	H	Me	4,5-Cl ₂ -噻唑-2-基	H
1-223	H	H	Me	2-嘧啶基	H
1-224	H	H	Me	2-嘧啶基	4-Me
1-225	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基	H

[0742]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
1-226	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
1-227	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
1-228	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
1-229	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	4-Me
1-230	H	H	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基	H
1-231	H	H	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基	4-Me
1-232	H	H	Me	3-哒嗪基	H
1-233	H	H	Me	6-Me-哒嗪-3-基	H
1-234	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基	H
1-235	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H
1-236	H	H	Me	异喹啉-3-基	H
1-237	H	H	Me	喹啉-2-基	H
1-238	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	H
1-239	H	H	Me	2-Me-吡啶-4-基	H
1-240	H	H	Me	4-Cl-6-Me-吡啶-2-基	H
1-241	H	H	Me	4-Br-3-Me-Ph	H
1-242	H	H	Me	5-Cl-吡啶-3-基	H
1-243	H	H	Me	5-烯丙基吡啶-2-基	H
1-244	H	H	Me	5-环丙基吡啶-2-基	H
1-245	H	H	Me	5-乙炔基吡啶-2-基	H
1-246	H	H	Me	5-Ph-吡啶-2-基	H
1-247	H	H	Me	5-I-吡啶-2-基	H
1-248	H	H	Me	5-I-嘧啶-2-基	H
1-249	H	H	Cl	4-F-Ph	H
1-250	H	H	Cl	3-吡啶基	H

1-251	H	H	Cl	5-Cl-吡啶-2-基	H
1-252	H	H	Cl	5-Br-吡啶-2-基	H
1-253	H	H	Cl	5-F-吡啶-2-基	H
1-254	H	H	Cl	5-I-吡啶-2-基	H
1-255	H	H	Cl	5-Me-吡啶-2-基	H
1-256	H	H	Cl	6-Me-吡啶-3-基	H
1-257	H	H	Cl	4-Me-吡啶-2-基	H
1-258	H	H	Cl	4-F-吡啶-2-基	H
1-259	H	H	Cl	4-Cl-吡啶-2-基	H
1-260	H	H	Cl	4-Br-吡啶-2-基	H
1-261	H	H	Cl	4-OMe-吡啶-2-基	H
1-262	H	H	Cl	2-嘧啶基	H
1-263	H	H	Cl	5-F-嘧啶-2-基	H
1-264	H	H	Cl	5-Cl-嘧啶-2-基	H

[0743]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
1-265	H	H	Cl	5-Br-嘧啶-2-基	H
1-266	H	H	Cl	5-I-嘧啶-2-基	H
1-267	H	H	Cl	5-Me-嘧啶-2-基	H
1-268	H	H	Cl	5-Me-吡嗪-2-基	H
1-269	H	H	Cl	2-吡嗪基	H
1-270	H	H	Cl	异喹啉-3-基	H
1-271	H	H	Cl	喹啉-2-基	H
1-272	H	H	Cl	1,3-苯并噻唑-2-基	H
1-273	H	H	Cl	7-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
1-274	H	H	Cl	2-噻唑基	H
1-275	H	H	Cl	5-Br-噻唑-2-基	H
1-276	H	H	Cl	5-Me-噻唑-2-基	H
1-277	H	H	Cl	5-Cl-噻唑-2-基	H
1-278	H	H	Cl	2-噻吩基	H
1-279	H	H	Cl	3-Me-2-噻吩基	H
1-280	H	H	Cl	4-Me-2-噻吩基	H
1-281	H	H	Cl	5-Br-2-噻吩基	H
1-282	H	H	Cl	5-Cl-2-噻吩基	H
1-283	H	H	Me	4-噻唑基	H
1-284	H	H	Me	3-Br-Me	H
1-285	H	H	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
1-286	H	H	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
1-287	H	H	Me	5-OSO ₂ Me-吡啶-2-基	H
1-288	H	H	Me	6-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
1-289	H	H	Me	6-Br-1,3-苯并噻唑-2-基	H
1-290	H	H	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H
1-291	H	H	Me	6-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
1-292	H	H	Me	6-Br-1,3-苯并噻唑-2-基	H
1-293	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
1-294	H	H	Me	5-NH ₂ -吡啶-2-基	H
1-295	H	H	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
1-296	H	H	Me	5-OCHF ₂ -吡啶-2-基	H
1-297	H	H	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
1-298	H	H	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
1-299	H	H	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
1-300	H	H	Me	5-NMe ₂ -吡啶-2-基	H

[0744] 此外,还生成了本发明的通式(I)化合物的NMR数据。示例性化合物的NMR各自以在400MHz(CDCl₃或DMSO-D₆)下的¹H-NMR谱(¹H核磁共振数据)记录。一些示例性化合物的特征化学位移δ(ppm)如下所列:

[0745] NMR化合物1-116(DMSO-D₆,400MHz,δ单位为ppm):

[0746] 2.28(s,3H);3.54(s,2H);7.61(d,1H);8.11(dd,1H);8.61(d,1H);8.66(s,2H);9.10(s,1H)。m.p.:234.3℃。

[0747] NMR化合物1-214(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0748] 2.43(s,3H);2.68(s,3H);3.54(s,2H);8.43(s,1H);8.55(s,1H);8.70(s,2H);9.15(s,1H)。m.p.:195.6℃。

[0749] NMR化合物1-236(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0750] 2.47(s,3H);3.56(s,2H);7.39(m,1H);7.69(m,1H);7.78-7.86(m,2H);8.13(m,1H);8.73(s,2H);9.14(s,1H);9.40(s,1H)。m.p.:103.9℃。

[0751] NMR化合物1-154(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0752] 2.43(s,3H);3.52(s,2H);3.73(s,3H);6.42(m,1H);6.98(m,1H);8.57(m,1H);8.72(s,2H);9.18(s,1H);15.3(brs,1H)。m.p.:173℃。

[0753] NMR化合物1-119(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0754] 2.42(s,3H);3.55(s,2H);6.98(m,1H);7.92(m,1H);8.70(s,2H);8.83(m,1H);9.19(s,1H)。

[0755] NMR化合物1-210(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

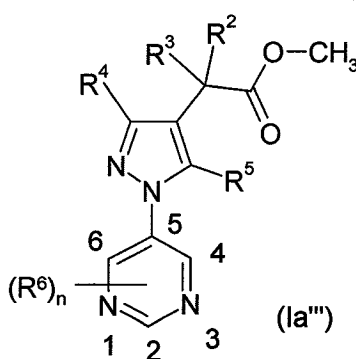
[0756] 2.22(s,3H);2.43(s,3H);2.66(s,3H);3.50(s,2H);6.61(s,1H);7.13(s,1H);8.72(s,2H);9.17(s,1H)。

[0757] NMR化合物1-28(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0758] 2.38(s,3H);3.44(s,2H);7.20(d,2H);7.41(d,2H);8.62(s,2H);9.04(s,1H)。

[0759] 表2:式(Ia'")的化合物

[0760]



[0761]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
2-1	H	H	Ph	Ph	H
2-2	H	H	Me	Ph	H
2-3	H	H	Me	5-I-2-噻吩基	H
2-4	H	H	Me	2-咪唑基	H
2-5	H	H	Me	Ph	2-OMe
2-6	Me	H	Me	Ph	4-Me

2-7	H	H	Me	Ph	2-Cl
2-8	H	H	Me	Ph	4-CF ₃
2-9	H	H	Me	Ph	2-CF ₃
2-10	H	H	Me	Ph	4-Me
2-11	H	H	Me	Ph	2,4-Me ₂
2-12	H	H	Me	Ph	2,4-Cl ₂
2-13	H	H	Me	4-MeO-Ph	4-Me
2-14	H	H	Me	4-MeO-Ph	H
2-15	Me	H	Me	Ph	H
2-16	H	H	Me	4-Me-Ph	H
2-17	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
2-18	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Cl
2-19	H	H	Me	3-Cl-Ph	H
2-20	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	H
2-21	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	4-Me
2-22	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	4-Me
2-23	H	H	Me	3-Cl-Ph	4-Me
2-24	H	H	Me	2-Cl-Ph	4-Me
2-25	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	4-Me

[0762]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
2-26	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	4-Me
2-27	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Me
2-28	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
2-29	H	H	Me	4-Cl-Ph	2-Cl
2-30	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	H
2-31	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	H
2-32	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Cl
2-33	H	H	Me	Ph	4-Cl
2-34	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
2-35	H	H	Me	4-tBu-Ph	4-Me
2-36	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph	4-Me
2-37	H	H	Me	Ph	4-OMe
2-38	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-OMe
2-39	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
2-40	H	H	Me	4-F-Ph	4-Me
2-41	H	H	Me	4-F-Ph	4-Cl
2-42	H	H	Me	3-Me-Ph	4-Me
2-43	H	H	Me	4-COOH-Ph	4-Me
2-44	H	H	Me	3-Br-Ph	4-Me
2-45	H	H	Me	4-Ph-Ph	4-Me
2-46	H	H	Me	4-COOH-Ph	H
2-47	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph	H
2-48	H	H	Me	Ph	4-SMe
2-49	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SMe
2-50	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H
2-51	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	H
2-52	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	4-Me
2-53	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	4-Me
2-54	H	H	Me	2-吡啶基	4-Cl
2-55	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-F
2-56	H	H	Me	2-噻吩基	4-Me

2-57	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	4-Me
2-58	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	4-Me
2-59	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Me
2-60	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Cl
2-61	H	H	Me	3-噻吩基	4-Me
2-62	H	H	Me	2-噻吩基	H
2-63	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	H
2-64	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	H

[0763]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
2-65	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
2-66	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基	H
2-67	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
2-68	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	H
2-69	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	4-Me
2-70	H	H	Me	3-噻吩基	H
2-71	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-S(O)Me
2-72	H	H	Me	4-Br-Ph	4-Me
2-73	H	H	Me	1,3-苯并二氧杂环戊烯-5-基	4-Me
2-74	H	H	Me	4-I-Ph	4-Me
2-75	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	4-Me
2-76	H	H	Me	4-PhO-Ph	4-Me
2-77	H	H	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
2-78	H	H	Me	Ph	4-S(O)Me
2-79	H	H	H	Ph	H
2-80	H	H	H	Ph	4-Me
2-81	H	H	Et	Ph	H
2-82	H	H	n-Pr	Ph	H
2-83	H	H	CH ₂ Cl	Ph	H
2-84	H	H	CHCl ₂	Ph	H
2-85	H	H	CH ₂ F	Ph	H
2-86	H	H	CHF ₂	Ph	H
2-87	H	H	Cl	Ph	H
2-88	H	H	Et	Ph	4-Me
2-89	H	H	n-Pr	Ph	4-Me
2-90	H	H	CH ₂ Cl	Ph	4-Me
2-91	H	H	CHCl ₂	Ph	4-Me
2-92	H	H	CH ₂ F	Ph	4-Me
2-93	H	H	CHF ₂	Ph	4-Me
2-94	H	H	Cl	Ph	4-Me
2-95	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
2-96	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
2-97	H	H	CH ₂ Cl	4-Cl-Ph	H
2-98	H	H	CHCl ₂	4-Cl-Ph	H
2-99	H	H	CH ₂ F	4-Cl-Ph	H
2-100	H	H	CHF ₂	4-Cl-Ph	H
2-101	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
2-102	H	H	Et	4-Me-Ph	H
2-103	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H

[0764]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
----	----------------	----------------	----------------	----------------	--------------------------------

2-104	H	H	CH ₂ Cl	4-Me-Ph	H
2-105	H	H	CHCl ₂	4-Me-Ph	H
2-106	H	H	CH ₂ F	4-Me-Ph	H
2-107	H	H	CHF ₂	4-Me-Ph	H
2-108	H	H	Cl	4-Me-Ph	H
2-109	H	H	Et	2-吡啶基	H
2-110	H	H	n-Pr	2-吡啶基	H
2-111	H	H	CH ₂ Cl	2-吡啶基	H
2-112	H	H	CHCl ₂	2-吡啶基	H
2-113	H	H	CH ₂ F	2-吡啶基	H
2-114	H	H	CHF ₂	2-吡啶基	H
2-115	H	H	Cl	2-吡啶基	H
2-116	H	H	Me	2-吡啶基	H
2-117	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
2-118	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Cl
2-119	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Me
2-120	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
2-121	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Cl
2-122	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Me
2-123	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
2-124	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
2-125	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	4-Me
2-126	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	H
2-127	H	H	Me	4-(CH ₂ COOH)-Ph	4-Me
2-128	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	4-Me
2-129	H	H	Me	4-Br-Ph	4-Me
2-130	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	H
2-131	H	H	Me	3-Me-Ph	H
2-132	H	H	Me	4-F-Ph	H
2-133	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
2-134	H	H	Me	4-tBu-Ph	H
2-135	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
2-136	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	4-Me
2-137	H	H	Me	3-吡啶基	H
2-138	H	H	Me	4-吡啶基	H
2-139	H	H	C(O)OMe	Ph	H
2-140	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
2-141	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SO ₂ Me
2-142	H	H	Me	3-吡啶基	4-Me

[0765]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
2-143	H	H	Me	2,3-Cl ₂ -Ph	4-Me
2-144	H	H	Me	2-吡啶基	4-Me
2-145	H	H	H	4-Cl-Ph	4-Me
2-146	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
2-147	H	H	Me	Ph	2-Me
2-148	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
2-149	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Me
2-150	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Cl
2-151	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-F
2-152	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H
2-153	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H

2-154	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
2-155	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
2-156	H	H	Me	5-CF ₃ -吡啶-2-基	H
2-157	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
2-158	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
2-159	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
2-160	H	H	CN	4-Cl-Ph	4-Me
2-161	H	H	CN	4-Me-Ph	H
2-162	H	H	CN	4-Me-Ph	4-Me
2-163	H	H	CN	Ph	H
2-164	H	H	CN	Ph	4-Me
2-165	H	H	CN	2-吡啶基	H
2-166	H	H	CN	3-吡啶基	H
2-167	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H
2-168	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H
2-169	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
2-170	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H
2-171	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
2-172	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
2-173	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
2-174	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
2-175	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
2-176	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
2-177	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	H
2-178	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	4-Me
2-179	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	H
2-180	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	4-Me
2-181	H	H	甲酰基	Ph	H

[0766]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
2-182	H	H	甲酰基	Ph	4-Me
2-183	H	H	甲酰基	2-吡啶基	H
2-184	H	H	甲酰基	3-吡啶基	H
2-185	H	H	甲酰基	5-Cl-吡啶-2-基	H
2-186	H	H	甲酰基	5-Br-吡啶-2-基	H
2-187	H	H	甲酰基	5-F-吡啶-2-基	H
2-188	H	H	甲酰基	5-Me-吡啶-2-基	H
2-189	H	H	甲酰基	6-Me-吡啶-3-基	H
2-190	H	H	甲酰基	4-Me-吡啶-2-基	H
2-191	H	H	甲酰基	4-F-吡啶-2-基	H
2-192	H	H	甲酰基	4-Cl-吡啶-2-基	H
2-193	H	H	甲酰基	4-Br-吡啶-2-基	H
2-194	H	H	甲酰基	4-OMe-吡啶-2-基	H
2-195	H	H	CH ₂ OH	5-Me-吡啶-2-基	H
2-196	H	H	CH ₂ OH	4-Cl-Ph	H
2-197	H	H	CH ₂ OH	4-Me-吡啶-2-基	H
2-198	H	H	CH ₂ OH	4-Me-Ph	H
2-199	H	H	CH ₂ OH	Ph	H
2-200	H	H	CH ₂ OH	2-吡啶基	H
2-201	H	H	Me	2-噻唑基	H
2-202	H	H	Me	2-噻唑基	4-Cl
2-203	H	H	Me	2-噻唑基	4-Me

2-204	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
2-205	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Cl
2-206	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Me
2-207	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
2-208	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
2-209	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	4-Me
2-210	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
2-211	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	H
2-212	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	4-Me
2-213	H	H	Me	2-吡啶基	4-F
2-214	H	H	Me	2-吡嗪基	H
2-215	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
2-216	H	H	Me	2-吡嗪基	4-Me
2-217	H	H	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H
2-218	H	H	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	4-Me
2-219	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
2-220	H	H	Me	1,5-Me ₂ -吡啶-3-基	H

[0767]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
2-221	H	H	Me	1,5-Me ₂ -吡啶-3-基	4-Me
2-222	H	H	Me	4,5-Me ₂ -噻唑-2-基	H
2-223	H	H	Me	4,5-Cl ₂ -噻唑-2-基	H
2-224	H	H	Me	2-噻啶基	H
2-225	H	H	Me	2-噻啶基	4-Me
2-226	H	H	Me	5-F-噻啶-2-基	H
2-227	H	H	Me	5-Cl-噻啶-2-基	H
2-228	H	H	Me	5-Br-噻啶-2-基	H
2-229	H	H	Me	5-Me-噻啶-2-基	H
2-230	H	H	Me	5-Me-噻啶-2-基	4-Me
2-231	H	H	Me	4,6-Me ₂ -噻啶-2-基	H
2-232	H	H	Me	4,6-Me ₂ -噻啶-2-基	4-Me
2-233	H	H	Me	3-哒嗪基	H
2-234	H	H	Me	6-Me-哒嗪-3-基	H
2-235	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基	H
2-236	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H
2-237	H	H	Me	4-Cl-Ph	2-OMe
2-238	H	H	Me	2-吡啶基	2-SO ₂ Me
2-239	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
2-240	H	H	Me	4-Br-Ph	H
2-241	H	H	Me	异喹啉-3-基	H
2-242	H	H	Me	喹啉-2-基	H
2-243	H	H	Me	4-NO ₂ -Ph	H
2-244	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	H
2-245	H	H	Me	2-Me-吡啶-4-基	H
2-246	H	H	Me	4-Cl-6-Me-吡啶-2-基	H
2-247	H	H	Me	4-Br-3-Me-Ph	H
2-248	H	H	Me	5-Cl-吡啶-3-基	H
2-249	H	H	Me	5-烯丙基吡啶-2-基	H
2-250	H	H	Me	5-环丙基吡啶-2-基	H
2-251	H	H	Me	5-乙炔基吡啶-2-基	H
2-252	H	H	Me	5-Ph-吡啶-2-基	H
2-253	H	H	Me	5-I-吡啶-2-基	H

2-254	H	H	Me	5-I- 嘧啶-2-基	H
2-255	H	H	Cl	4-F-Ph	H
2-256	H	H	Cl	3-吡啶基	H
2-257	H	H	Cl	5-Cl- 吡啶-2-基	H
2-258	H	H	Cl	5-Br- 吡啶-2-基	H
2-259	H	H	Cl	5-F- 吡啶-2-基	H

[0768]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
2-260	H	H	Cl	5-I- 吡啶-2-基	H
2-261	H	H	Cl	5-Me- 吡啶-2-基	H
2-262	H	H	Cl	6-Me- 吡啶-3-基	H
2-263	H	H	Cl	4-Me- 吡啶-2-基	H
2-264	H	H	Cl	4-F- 吡啶-2-基	H
2-265	H	H	Cl	4-Cl- 吡啶-2-基	H
2-266	H	H	Cl	4-Br- 吡啶-2-基	H
2-267	H	H	Cl	4-OMe- 吡啶-2-基	H
2-268	H	H	Cl	2- 嘧啶基	H
2-269	H	H	Cl	5-F- 嘧啶-2-基	H
2-270	H	H	Cl	5-Cl- 嘧啶-2-基	H
2-271	H	H	Cl	5-Br- 嘧啶-2-基	H
2-272	H	H	Cl	5-I- 嘧啶-2-基	H
2-273	H	H	Cl	5-Me- 嘧啶-2-基	H
2-274	H	H	Cl	5-Me- 吡嗪-2-基	H
2-275	H	H	Cl	2- 吡嗪基	H
2-276	H	H	Cl	异喹啉-3-基	H
2-277	H	H	Cl	喹啉-2-基	H
2-278	H	H	Cl	1,3- 苯并噻唑-2-基	H
2-279	H	H	Cl	7-Cl-1,3- 苯并噻唑-2-基	H
2-280	H	H	Cl	2- 噻唑基	H
2-281	H	H	Cl	5-Br- 噻唑-2-基	H
2-282	H	H	Cl	5-Me- 噻唑-2-基	H
2-283	H	H	Cl	5-Cl- 噻唑-2-基	H
2-284	H	H	Cl	2- 噻吩基	H
2-285	H	H	Cl	3-Me-2- 噻吩基	H
2-286	H	H	Cl	4-Me-2- 噻吩基	H
2-287	H	H	Cl	5-Br-2- 噻吩基	H
2-288	H	H	Cl	5-Cl-2- 噻吩基	H
2-289	H	H	Me	3-Br-Ph	H
2-290	H	H	Me	4- 噻唑基	H
2-291	H	H	Me	2-Cl- 噻唑-4-基	H
2-292	H	H	Me	2-Br- 噻唑-4-基	H
2-293	H	H	Me	5-OSO ₂ Me- 吡啶-2-基	H
2-294	H	H	Me	6-Cl-1,3- 苯并噻唑-2-基	H
2-295	H	H	Me	6-Br-1,3- 苯并噻唑-2-基	H
2-296	H	H	Me	1,3- 苯并噻唑-2-基	H
2-297	H	H	Me	6-Cl-1,3- 苯并噻唑-2-基	H
2-298	H	H	Me	6-Br-1,3- 苯并噻唑-2-基	H

[0769]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
2-299	H	H	Me	7-Cl-1,3- 苯并噻唑-2-基	H
2-300	H	H	Me	5-NH ₂ - 吡啶-2-基	H

2-301	H	H	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
2-302	H	H	Me	5-OCHF ₂ -吡啶-2-基	H
2-303	H	H	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
2-304	H	H	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
2-305	H	H	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
2-306	H	H	Me	5-NMe ₂ -吡啶-2-基	H

[0770] 此外,还生成了本发明的通式(I)化合物的NMR数据。示例性化合物的NMR各自以在400MHz(CDCl₃)下的¹H-NMR谱(¹H核磁共振数据)记录。一些示例性化合物的特征化学位移δ(ppm)如下所列:

[0771] NMR化合物2-237(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0772] 2.32(s,3H);3.39(s,2H);3.70(s,3H);4.00(s,3H);7.18(d,2H);7.39(d,2H);8.38(s,2H)。

[0773] NMR化合物2-117(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0774] 2.35(s,3H);3.52(s,2H);3.71(s,3H);7.45(d,1H);7.77(dd,1H);8.53(d,1H);8.65(s,2H);9.08(s,1H)。

[0775] NMR化合物2-120(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0776] 2.38(s,3H);3.54(s,2H);3.72(s,3H);7.39(d,1H);7.92(dd,1H);8.64(d,1H);8.67(s,2H);9.09(s,1H)。

[0777] NMR化合物2-28(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0778] 2.36(s,3H);3.40(s,2H);3.71(s,3H);7.20(d,2H);7.41(d,2H);8.63(s,2H);9.03(s,1H)。

[0779] NMR化合物2-29(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0780] 2.34(s,3H);3.38(s,2H);3.72(s,3H);7.20(d,2H);7.44(d,2H);8.50(s,2H)。

[0781] NMR化合物2-116(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0782] 2.38(s,3H);3.57(s,2H);3.71(s,3H);7.32(m,1H);7.46(m,1H);7.69(m,1H);8.61(m,1H);8.63(s,2H);9.04(s,1H)。

[0783] NMR化合物2-238(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0784] 2.38(s,3H);3.33(s,3H);3.52(s,2H);3.72(s,3H);7.32(m,1H);7.58(m,1H);7.85(m,1H);8.62(m,1H);8.75(s,2H)。

[0785] NMR化合物2-239(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0786] 2.38(s,3H);2.39(s,3H);3.57(s,2H);3.73(s,3H);7.14(d,1H);7.26(s,1H);8.46(d,1H);8.67(s,2H);9.05(s,1H)。

[0787] NMR化合物2-215(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0788] 2.38(s,3H);2.61(s,3H);3.56(s,2H);3.72(s,3H);8.43(s,1H);8.60(s,1H);8.68(s,2H);9.09(s,1H)。m.p.:193°C。

[0789] NMR化合物2-135(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0790] 2.35(s,3H);2.36(s,3H);3.40(s,2H);3.72(s,3H);7.00(m,1H);7.11(m,1H);7.39(m,1H);8.62(s,2H);9.02(s,1H)。

[0791] NMR化合物2-16(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0792] 2.34(s,3H);2.39(s,3H);3.41(s,2H);3.71(s,3H);7.11(d,2H);7.22(d,2H);

8.63(s, 2H) ;9.01(s, 1H)。

[0793] NMR 化合物 2-132(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0794] 2.36(s, 3H) ;3.39(s, 2H) ;3.71(s, 3H) ;7.12(m, 2H) ;7.25(m, 2H) ;8.65(brs, 2H) ;9.05(brs, 1H)。

[0795] NMR 化合物 2-148(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0796] 2.39(s, 3H) ;2.40(s, 3H) ;3.57(s, 2H) ;3.74(s, 3H) ;7.14(dd, 2H) ;7.26(d, 2H) ;8.47(d, 1H) ;8.66(s, 2H) ;9.05(s, 1H)。

[0797] NMR 化合物 2-240(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0798] 2.37(s, 3H) ;3.39(s, 2H) ;3.72(s, 3H) ;7.13(d, 2H) ;7.58(d, 2H) ;8.63(s, 2H) ;9.04(s, 1H)。

[0799] NMR 化合物 2-65(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0800] 2.33(s, 3H) ;3.48(s, 2H) ;3.72(s, 3H) ;6.87(d, 2H) ;6.93(d, 2H) ;8.75(brs, 2H) ;9.11(brs, 1H)。

[0801] NMR 化合物 2-64(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0802] 2.25(s, 3H) ;2.33(s, 3H) ;3.48(s, 2H) ;3.72(s, 3H) ;6.85(d, 2H) ;7.05(d, 2H) ;8.73(brs, 2H) ;9.09(brs, 1H)。

[0803] NMR 化合物 2-47(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0804] 2.28(s, 6H) ;2.35(s, 3H) ;3.41(s, 2H) ;3.70(s, 3H) ;6.82(s, 2H) ;7.05(s, 1H) ;8.63(s, 2H) ;9.01(s, 1H)。

[0805] NMR 化合物 2-241(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0806] 2.40(s, 3H) ;3.59(s, 2H) ;3.73(s, 3H) ;7.72(m, 1H) ;7.78(m, 1H) ;7.87(m, 1H) ;7.92(s, 1H) ;8.01(m, 1H) ;8.67(s, 2H) ;9.02(s, 1H) ;9.18(s, 1H)。m. p. :100.7°C。

[0807] NMR 化合物 2-217(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0808] 2.48(s, 3H) ;3.71(s, 3H) ;3.81(s, 2H) ;7.43(t, 1H) ;7.51(t, 1H) ;7.89(d, 1H) ;8.00(d, 1H) ;8.82(s, 2H) ;9.17(s, 1H)。

[0809] NMR 化合物 2-243(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0810] 2.38(s, 3H) ;3.42(s, 2H) ;3.73(s, 3H) ;7.48(d, 2H) ;8.30(d, 2H) ;8.61(s, 2H) ;9.08(s, 1H)。

[0811] NMR 化合物 2-68(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0812] 2.33(s, 3H) ;3.48(s, 2H) ;3.72(s, 3H) ;6.83(d, 2H) ;7.08(d, 2H) ;8.73(s, 2H) ;9.11(s, 1H)。

[0813] NMR 化合物 2-224(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0814] 2.37(s, 3H) ;3.68(s, 3H) ;3.96(s, 2H) ;7.17(t, 1H) ;8.64(d, 2H) ;8.74(s, 2H) ;9.14(s, 1H)。

[0815] NMR 化合物 2-2(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0816] 2.36(s, 3H) ;3.41(s, 2H) ;3.70(s, 3H) ;7.24(m, 2H) ;7.43(m, 3H) ;8.61(s, 2H) ;9.01(s, 1H)。

[0817] NMR 化合物 2-289(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0818] 2.36(s, 3H) ;3.41(s, 2H) ;3.72(s, 3H) ;7.14(m, 1H) ;7.29(m, 1H) ;7.44(m, 1H) ;

7. 58(m, 1H) ;8. 63(s, 2H) ;9. 03(s, 1H)。

[0819] NMR 化合物 2-247(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0820] 2. 34(s, 3H) ;2. 37(s, 3H) ;3. 39(s, 2H) ;3. 71(s, 3H) ;6. 92(m, 1H) ;7. 13(m, 1H) ;7. 58(m, 1H) ;8. 64(s, 2H) ;9. 04(s, 1H)。

[0821] NMR 化合物 2-124(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0822] 2. 38(s, 3H) ;2. 39(s, 3H) ;3. 54(s, 2H) ;3. 70(s, 3H) ;7. 33(m, 1H) ;7. 59(m, 1H) ;8. 42(s, 1H) ;8. 63(s, 2H) ;9. 03(s, 1H)。

[0823] NMR 化合物 2-155(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0824] 2. 38(s, 3H) ;3. 55(s, 2H) ;3. 72(s, 3H) ;3. 86(s, 3H) ;6. 82(m, 1H) ;7. 10(m, 1H) ;8. 39(m, 1H) ;8. 64(s, 2H) ;9. 04(s, 1H)。m. p. :161. 7℃。

[0825] NMR 化合物 2-249(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0826] 2. 37(s, 3H) ;3. 56(s, 2H) ;3. 71(s, 3H) ;5. 48(m, 1H) ;5. 88(m, 1H) ;6. 71(m, 1H) ;7. 41(m, 1H) ;7. 80(m, 1H) ;8. 58(m, 1H) ;8. 65(s, 2H) ;9. 05(s, 1H)。

[0827] NMR 化合物 2-242(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0828] 2. 40(s, 3H) ;3. 68(s, 2H) ;3. 69(s, 3H) ;7. 43(m, 1H) ;7. 61(m, 1H) ;7. 72(m, 1H) ;7. 84(m, 1H) ;7. 95(m, 1H) ;8. 21(m, 1H) ;8. 69(s, 2H) ;9. 04(s, 1H)。

[0829] NMR 化合物 2-290(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0830] 2. 39(s, 3H) ;3. 53(s, 2H) ;3. 75(s, 3H) ;7. 75(s, 1H) ;8. 68(s, 2H) ;8. 83(s, 1H) ;9. 09(s, 1H)。

[0831] NMR 化合物 2-211(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0832] 2. 32(s, 3H) ;2. 35(s, 3H) ;2. 40(s, 3H) ;3. 54(s, 2H) ;3. 71(s, 3H) ;7. 00(s, 1H) ;7. 06(s, 1H) ;8. 65(s, 2H) ;9. 03(s, 1H)。

[0833] NMR 化合物 2-66(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0834] 2. 32(s, 3H) ;2. 48(s, 3H) ;3. 48(s, 2H) ;3. 72(s, 3H) ;6. 72(d, 1H) ;6. 82(d, 1H) ;8. 72(s, 2H) ;9. 08(s, 1H)。

[0835] NMR 化合物 2-219(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

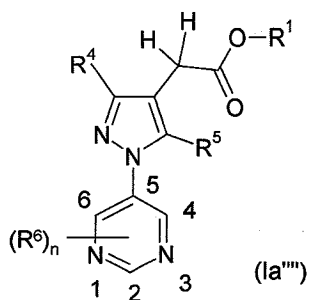
[0836] 2. 39(s, 3H) ;3. 73(s, 3H) ;3. 82(s, 2H) ;7. 43(m, 1H) ;7. 47(m, 1H) ;7. 89(m, 1H) ;8. 83(s, 2H) ;9. 19(s, 1H)。

[0837] NMR 化合物 2-244(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0838] 2. 35(s, 3H) ;3. 40(s, 2H) ;3. 72(s, 3H) ;7. 17(d, 2H) ;7. 43(t, 1H) ;8. 64(s, 2H) ;9. 09(s, 1H)。

[0839] 表 3 :式 (Ia^{'''}) 的化合物

[0840]



[0841]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-1	Et	Me	Ph	H
3-2	Et	Me	Ph	4-Me
3-3	Et	Me	3-Cl-Ph	H
3-4	Et	Me	4-Cl-Ph	H
3-5	Et	Me	4-Cl-Ph	4-Me
3-6	Et	Me	2- 噻吩基	H
3-7	Et	Me	3- 噻吩基	H
3-8	Et	Me	3-Me-2- 噻吩基	H
3-9	Et	Me	4-Me-2- 噻吩基	H
3-10	Et	Me	5-Br-2- 噻吩基	H
3-11	Et	Me	5-Br-2- 噻吩基	4-Me
3-12	Et	Me	5-Cl-2- 噻吩基	H
3-13	Et	Me	5-Cl-2- 噻吩基	4-Me
3-14	Et	Me	5-I-2- 噻吩基	H
3-15	Et	Me	5-Me-2- 噻吩基	H
3-16	Et	Me	3- 吡啶基	H
3-17	Et	Me	6-MeO- 吡啶 -3- 基	H
3-18	Et	Me	6-OH- 吡啶 -3- 基	H
3-19	Et	Me	6-Me- 吡啶 -3- 基	H
3-20	Et	Me	4-Me-Ph	H
3-21	Et	Me	4-Me-Ph	4-Me
3-22	Et	Me	4-Br-Ph	H
3-23	Et	Me	4-F-Ph	H
3-24	Et	Me	4-F-Ph	4-Me
3-25	Et	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
3-26	Et	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
3-27	Et	Me	5-F- 吡啶 -2- 基	H
3-28	Et	Me	5-F- 吡啶 -2- 基	4-Me
3-29	Et	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	4-Me
3-30	Et	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	4-Me
3-31	Et	Me	5-Me- 吡啶 -2- 基	H

[0842]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-32	Et	Me	5-Me- 吡啶 -2- 基	4-Me
3-33	Et	Me	2- 吡啶基	4-Me
3-34	Et	Me	2- 吡啶基	H
3-35	Et	Me	4- 吡啶基	H
3-36	Et	Me	4-Me- 吡啶 -2- 基	H
3-37	Et	Me	4-Me- 吡啶 -2- 基	4-Me
3-38	Et	Me	2- 噻唑基	H
3-39	Et	Me	4-Me- 噻唑 -2- 基	H
3-40	Et	Me	5-Br- 噻唑 -2- 基	H
3-41	Et	Me	5-Cl- 噻唑 -2- 基	H
3-42	Et	Me	5-Me- 噻唑 -2- 基	H
3-43	Et	Me	4,5-Me ₂ - 噻唑 -2- 基	H
3-44	Et	Me	4,5-Cl ₂ - 噻唑 -2- 基	H
3-45	Et	Me	4,6-Me ₂ - 吡啶 -2- 基	H
3-46	Et	Me	2- 吡嗪基	H
3-47	Et	Me	2- 嘧啶基	H
3-48	Et	Me	2- 嘧啶基	4-Me

3-49	Et	Me	5-Cl- 嘧啶 -2- 基	H
3-50	Et	Me	5-Br- 嘧啶 -2- 基	H
3-51	Et	Me	5-Me- 嘧啶 -2- 基	H
3-52	Et	Me	5-Me- 嘧啶 -2- 基	4-Me
3-53	Et	Me	4,6-Me ₂ - 嘧啶 -2- 基	H
3-54	Et	Me	4,6-Me ₂ - 嘧啶 -2- 基	4-Me
3-55	Et	Me	1,3- 苯并噻唑 -2- 基	H
3-56	Et	Me	7-Cl-1,3- 苯并噻唑 -2- 基	H
3-57	Et	Me	1,5-Me ₂ - 吡唑 -3- 基	H
3-58	Et	Me	5-Me- 吡嗪 -2- 基	H
3-59	Et	Me	5-F- 嘧啶 -2- 基	H
3-60	Et	Me	4,6-Me ₂ - 嘧啶 -2- 基	H
3-61	Et	Me	3- 哒嗪基	H
3-62	Et	Me	6-Me- 哒嗪 -3- 基	H
3-63	Et	Me	3-(1,2,4)- 三嗪基	H
3-64	Et	Me	6-Me-(1,2,4)- 三嗪 -3- 基	H
3-65	Pr	Me	Ph	H
3-66	Pr	Me	4-Cl-Ph	H
3-67	Pr	Me	2- 噻吩基	H
3-68	Pr	Me	3- 吡啶基	H
3-69	Pr	Me	6-Me- 吡啶 -3- 基	H
3-70	Pr	Me	4-Me-Ph	H

[0843]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-71	Pr	Me	4-Br-Ph	H
3-72	Pr	Me	4-F-Ph	H
3-73	Pr	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
3-74	Pr	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
3-75	Pr	Me	5-F- 吡啶 -2- 基	H
3-76	Pr	Me	5-Me- 吡啶 -2- 基	H
3-77	Pr	Me	2- 吡啶基	H
3-78	Pr	Me	4- 吡啶基	H
3-79	i-Pr	Me	Ph	H
3-80	i-Pr	Me	4-Cl-Ph	H
3-81	i-Pr	Me	2- 噻吩基	H
3-82	i-Pr	Me	3- 吡啶基	H
3-83	i-Pr	Me	6-Me- 吡啶 -3- 基	H
3-84	i-Pr	Me	4-Me-Ph	H
3-85	i-Pr	Me	4-Br-Ph	H
3-86	i-Pr	Me	4-F-Ph	H
3-87	i-Pr	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
3-88	i-Pr	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
3-89	i-Pr	Me	5-F- 吡啶 -2- 基	H
3-90	i-Pr	Me	5-Me- 吡啶 -2- 基	H
3-91	i-Pr	Me	2- 吡啶基	H
3-92	i-Pr	Me	4- 吡啶基	H
3-93	CH ₂ Ph	Me	Ph	H
3-94	CH ₂ Ph	Me	4-Cl-Ph	H
3-95	CH ₂ Ph	Me	2- 噻吩基	H
3-96	CH ₂ Ph	Me	2- 吡啶基	H
3-97	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	Ph	H
3-98	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	4-Cl-Ph	H

3-99	丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-100	丙-2-炔-1-基	Me	3-噻吩基	H
3-101	丙-2-炔-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
3-102	丙-2-炔-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
3-103	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-104	丙-2-炔-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
3-105	丙-2-炔-1-基	Me	3-吡啶基	H
3-106	丙-2-炔-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
3-107	丙-2-炔-1-基	H	Ph	H
3-108	丙-2-炔-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-109	丙-2-炔-1-基	Me	4-Me-Ph	H

[0844]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-110	丙-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-111	丙-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
3-112	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-113	丙-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-114	丙-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-115	丙-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-116	丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-117	丙-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
3-118	丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
3-119	丙-2-炔-1-基	Me	Ph	4-Me
3-120	环丙基甲基	Me	Ph	H
3-121	环丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-122	环丙基甲基	Me	2-噻吩基	H
3-123	环丙基甲基	Me	3-噻吩基	H
3-124	环丙基甲基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
3-125	环丙基甲基	Me	3-吡啶基	H
3-126	环丙基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-127	环丙基甲基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
3-128	环丙基甲基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
3-129	环丙基甲基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
3-130	环丙基甲基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
3-131	环丙基甲基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-132	环丙基甲基	Me	4-Me-Ph	H
3-133	环丙基甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-134	环丙基甲基	Me	4-F-Ph	H
3-135	环丙基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-136	环丙基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-137	环丙基甲基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-138	环丙基甲基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-139	环丙基甲基	Me	2-吡啶基	H
3-140	环丙基甲基	Me	4-吡啶基	H
3-141	环丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
3-142	环丙基甲基	Me	Ph	4-Me
3-143	环丙基甲基	H	Ph	H
3-144	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
3-145	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-146	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-147	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-148	(1-甲基环丙基)甲基	Me	Ph	H

[0845]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-149	(1-甲基环丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-150	(1-甲基环丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H
3-151	(1-甲基环丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H
3-152	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
3-153	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-154	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-155	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-156	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	Ph	H
3-157	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-158	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H
3-159	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H
3-160	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
3-161	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-162	丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-163	丁-2-炔-1-基	Me	3-噻吩基	H
3-164	丁-2-炔-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
3-165	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
3-166	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-167	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
3-168	丁-2-炔-1-基	Me	3-吡啶基	H
3-169	丁-2-炔-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
3-170	丁-2-炔-1-基	H	Ph	H
3-171	丁-2-炔-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-172	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-Ph	H
3-173	丁-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-174	丁-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
3-175	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-176	丁-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-177	丁-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-178	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-179	丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-180	丁-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
3-181	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
3-182	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	4-Me
3-183	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
3-184	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-185	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-186	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-187	1-环丙基乙基	Me	Ph	H

[0846]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-188	1-环丙基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-189	1-环丙基乙基	Me	2-噻吩基	H
3-190	1-环丙基乙基	Me	2-吡啶基	H
3-191	烯丙基	Me	Ph	H
3-192	烯丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-193	烯丙基	Me	2-噻吩基	H
3-194	烯丙基	Me	2-吡啶基	H
3-195	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H

3-196	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-197	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-198	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-199	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
3-200	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-201	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-202	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-203	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H
3-204	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-205	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-206	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-207	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
3-208	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-209	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-210	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-211	环丁基甲基	Me	Ph	H
3-212	环丁基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-213	环丁基甲基	Me	2-噻吩基	H
3-214	环丁基甲基	Me	2-吡啶基	H
3-215	环戊基甲基	Me	Ph	H
3-216	环戊基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-217	环戊基甲基	Me	2-噻吩基	H
3-218	环戊基甲基	Me	2-吡啶基	H
3-219	环己基甲基	Me	Ph	H
3-220	环己基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-221	环己基甲基	Me	2-噻吩基	H
3-222	环己基甲基	Me	2-吡啶基	H
3-223	丁-3-烯-1-基	Me	Ph	H
3-224	丁-3-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-225	丁-3-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-226	丁-3-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H

[0847]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-227	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
3-228	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-229	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-230	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	3-噻吩基	H
3-231	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
3-232	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
3-233	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-234	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
3-235	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	3-吡啶基	H
3-236	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
3-237	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
3-238	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-239	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-Ph	H
3-240	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-241	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-F-Ph	H
3-242	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-243	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-244	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-245	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H

3-246	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-247	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-吡啶基	H
3-248	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
3-249	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	Ph	4-Me
3-250	2-氯代丙-2-烯-1-基	H	Ph	H
3-251	2-甲氧基乙基	Me	Ph	H
3-252	2-甲氧基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-253	2-甲氧基乙基	Me	2-噻吩基	H
3-254	2-甲氧基乙基	Me	2-吡啶基	H
3-255	四氢呋喃-2-基甲基	Me	Ph	H
3-256	四氢呋喃-2-基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-257	四氢呋喃-2-基甲基	Me	2-噻吩基	H
3-258	四氢呋喃-2-基甲基	Me	2-吡啶基	H
3-259	2-(二甲基氨基)乙基	Me	Ph	H
3-260	2-(二甲基氨基)乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-261	2-(二甲基氨基)乙基	Me	2-噻吩基	H
3-262	2-(二甲基氨基)乙基	Me	2-吡啶基	H
3-263	氧杂环丁-3-基	Me	Ph	H
3-264	氧杂环丁-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-265	氧杂环丁-3-基	Me	2-噻吩基	H

[0848]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-266	氧杂环丁-3-基	Me	2-吡啶基	H
3-267	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	Ph	H
3-268	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-269	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	2-噻吩基	H
3-270	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	2-吡啶基	H
3-271	2,2,2-三氟乙基	Me	Ph	H
3-272	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-273	2,2,2-三氟乙基	Me	2-噻吩基	H
3-274	2,2,2-三氟乙基	Me	3-吡啶基	H
3-275	2,2,2-三氟乙基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-276	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Me-Ph	H
3-277	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-278	2,2,2-三氟乙基	Me	4-F-Ph	H
3-279	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-280	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-281	2,2,2-三氟乙基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-282	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-283	2,2,2-三氟乙基	Me	2-吡啶基	H
3-284	2,2,2-三氟乙基	Me	4-吡啶基	H
3-285	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	Ph	H
3-286	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
3-287	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	2-噻吩基	H
3-288	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	3-吡啶基	H
3-289	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-290	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
3-291	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
3-292	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-F-Ph	H
3-293	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-294	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-295	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H

3-296	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-297	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	2-吡啶基	H
3-298	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-吡啶基	H
3-299	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	Ph	H
3-300	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
3-301	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	2-噻吩基	H
3-302	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	3-吡啶基	H
3-303	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-304	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-Me-Ph	H

[0849]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-305	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
3-306	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-F-Ph	H
3-307	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-308	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-309	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-310	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-311	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	2-吡啶基	H
3-312	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-吡啶基	H
3-313	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	Ph	H
3-314	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
3-315	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	2-噻吩基	H
3-316	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	3-吡啶基	H
3-317	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-318	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
3-319	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
3-320	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-F-Ph	H
3-321	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-322	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-323	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-324	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-325	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	2-吡啶基	H
3-326	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-吡啶基	H
3-327	2,2-二氟乙基	Me	Ph	H
3-328	2,2-二氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-329	2,2-二氟乙基	Me	2-噻吩基	H
3-330	2,2-二氟乙基	Me	2-吡啶基	H
3-331	Ph	Me	Ph	H
3-332	Ph	Me	4-Cl-Ph	H
3-333	Ph	Me	2-噻吩基	H
3-334	Ph	Me	2-吡啶基	H
3-335	2-氟乙基	Me	Ph	H
3-336	2-氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-337	2-氟乙基	Me	2-噻吩基	H
3-338	2-氟乙基	Me	2-吡啶基	H
3-339	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	Ph	H
3-340	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-341	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-噻吩基	H
3-342	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-吡啶基	H
3-343	1-乙基-5-甲基-1H-吡唑-4-甲基	Me	Ph	H

[0850]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-344	1-乙基-5-甲基-1H-吡唑-4-基甲基	Me	4-C1-Ph	H
3-345	1-乙基-5-甲基-1H-吡唑-4-基甲基	Me	2-噻吩基	H
3-346	1-乙基-5-甲基-1H-吡唑-4-基甲基	Me	2-吡啶基	H
3-347	Et	Me	异喹啉-3-基	H
3-348	Et	Me	喹啉-2-基	H
3-349	丙-2-炔-1-基	Me	异喹啉-3-基	H
3-350	丙-2-炔-1-基	Me	喹啉-2-基	H
3-351	丁-2-炔-1-基	Me	异喹啉-3-基	H
3-352	丁-2-炔-1-基	Me	喹啉-2-基	H
3-353	2,2-二氟乙基	Me	5-C1-吡啶-2-基	H
3-354	丁-3-炔-2-基	Me	5-C1-吡啶-2-基	H
3-355	丁-3-炔-2-基	Me	异喹啉-3-基	H
3-356	丁-3-炔-2-基	Me	喹啉-2-基	H
3-357	丁-3-炔-2-基	Me	Ph	H
3-358	丁-3-炔-2-基	Me	4-C1-Ph	H
3-359	丁-3-炔-2-基	Me	2-噻吩基	H
3-360	丁-3-炔-2-基	Me	3-吡啶基	H
3-361	丁-3-炔-2-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-362	丁-3-炔-2-基	Me	4-Me-Ph	H
3-363	丁-3-炔-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-364	丁-3-炔-2-基	Me	4-F-Ph	H
3-365	丁-3-炔-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-366	丁-3-炔-2-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-367	丁-3-炔-2-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-368	丁-3-炔-2-基	Me	2-吡啶基	H
3-369	丁-3-炔-2-基	Me	4-吡啶基	H
3-370	Pr	Me	异喹啉-3-基	H
3-371	Pr	Me	喹啉-2-基	H
3-372	iPr	Me	异喹啉-3-基	H
3-373	iPr	Me	喹啉-2-基	H
3-374	CH ₂ Ph	Me	异喹啉-3-基	H
3-375	CH ₂ Ph	Me	喹啉-2-基	H
3-376	环丙基甲基	Me	异喹啉-3-基	H
3-377	环丙基甲基	Me	喹啉-2-基	H
3-378	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	异喹啉-3-基	H
3-379	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	喹啉-2-基	H
3-380	(1-甲基环丙基)甲基	Me	异喹啉-3-基	H
3-381	(1-甲基环丙基)甲基	Me	喹啉-2-基	H
3-382	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	异喹啉-3-基	H

[0851]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-383	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	喹啉-2-基	H
3-384	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	异喹啉-3-基	H
3-385	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	喹啉-2-基	H
3-386	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	异喹啉-3-基	H
3-387	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	喹啉-2-基	H
3-388	1-环丙基乙基	Me	异喹啉-3-基	H
3-389	1-环丙基乙基	Me	喹啉-2-基	H
3-390	烯丙基	Me	异喹啉-3-基	H
3-391	烯丙基	Me	喹啉-2-基	H
3-392	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	异喹啉-3-基	H

3-393	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	喹啉-2-基	H
3-394	环丁基甲基	Me	异喹啉-3-基	H
3-395	环丁基甲基	Me	喹啉-2-基	H
3-396	环戊基甲基	Me	异喹啉-3-基	H
3-397	环戊基甲基	Me	喹啉-2-基	H
3-398	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	异喹啉-3-基	H
3-399	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	喹啉-2-基	H
3-400	四氢呋喃-2-基甲基	Me	异喹啉-3-基	H
3-401	四氢呋喃-2-基甲基	Me	喹啉-2-基	H
3-402	四氢呋喃-2-基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-403	四氢呋喃-2-基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-404	氧杂环丁-3-基	Me	异喹啉-3-基	H
3-405	氧杂环丁-3-基	Me	喹啉-2-基	H
3-406	氧杂环丁-3-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-407	氧杂环丁-3-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-408	氧杂环丁-3-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-409	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	异喹啉-3-基	H
3-410	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	喹啉-2-基	H
3-411	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-412	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-413	2,2,2-三氟乙基	Me	异喹啉-3-基	H
3-414	2,2,2-三氟乙基	Me	喹啉-2-基	H
3-415	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-416	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-417	2,2-二氟乙基	Me	异喹啉-3-基	H
3-418	2,2-二氟乙基	Me	喹啉-2-基	H
3-419	2,2-二氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-420	2,2-二氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-421	Et	Me	5-I-吡啶-2-基	H

[0852]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-422	Et	Me	5-I-嘧啶-2-基	H
3-423	Et	Cl	4-F-Ph	H
3-424	Et	Cl	3-吡啶基	H
3-425	Et	Cl	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-426	Et	Cl	5-Br-吡啶-2-基	H
3-427	Et	Cl	5-F-吡啶-2-基	H
3-428	Et	Cl	5-I-吡啶-2-基	H
3-429	Et	Cl	5-Me-吡啶-2-基	H
3-430	Et	Cl	6-Me-吡啶-3-基	H
3-431	Et	Cl	4-Me-吡啶-2-基	H
3-432	Et	Cl	4-F-吡啶-2-基	H
3-433	Et	Cl	4-Cl-吡啶-2-基	H
3-434	Et	Cl	4-Br-吡啶-2-基	H
3-435	Et	Cl	4-OMe-吡啶-2-基	H
3-436	Et	Cl	2-嘧啶基	H
3-437	Et	Cl	5-F-嘧啶-2-基	H
3-438	Et	Cl	5-Cl-嘧啶-2-基	H
3-439	Et	Cl	5-Br-嘧啶-2-基	H
3-440	Et	Cl	5-I-嘧啶-2-基	H
3-441	Et	Cl	5-Me-嘧啶-2-基	H
3-442	Et	Cl	5-Me-吡嗪-2-基	H

3-443	Et	Cl	2-吡嗪基	H
3-444	Et	Cl	异喹啉-3-基	H
3-445	Et	Cl	喹啉-2-基	H
3-446	Et	Cl	1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-447	Et	Cl	7-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-448	Et	Cl	2-噻唑基	H
3-449	Et	Cl	5-Br-噻唑-2-基	H
3-450	Et	Cl	5-Me-噻唑-2-基	H
3-451	Et	Cl	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-452	Et	Cl	2-噻吩基	H
3-453	Et	Cl	3-Me-2-噻吩基	H
3-454	Et	Cl	4-Me-2-噻吩基	H
3-455	Et	Cl	5-Br-2-噻吩基	H
3-456	Et	Cl	5-Cl-2-噻吩基	H
3-457	Et	Me	3-Br-Ph	H
3-458	Et	Me	4-噻唑基	H
3-459	环丙基甲基	Me	4-噻唑基	H
3-460	丙-2-炔-1-基	Me	4-噻唑基	H

[0853]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-461	丁-2-炔-1-基	Me	4-噻唑基	H
3-462	丁-3-炔-2-基	Me	4-噻唑基	H
3-463	Pr	Me	4-噻唑基	H
3-464	iPr	Me	4-噻唑基	H
3-465	CH ₂ Ph	Me	4-噻唑基	H
3-466	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	4-噻唑基	H
3-467	(1-甲基环丙基)甲基	Me	4-噻唑基	H
3-468	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	4-噻唑基	H
3-469	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	4-噻唑基	H
3-470	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	4-噻唑基	H
3-471	1-环丙基乙基	Me	4-噻唑基	H
3-472	烯丙基	Me	4-噻唑基	H
3-473	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-噻唑基	H
3-474	环丁基甲基	Me	4-噻唑基	H
3-475	环戊基甲基	Me	4-噻唑基	H
3-476	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-噻唑基	H
3-477	四氢呋喃-2-基甲基	Me	4-噻唑基	H
3-478	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	4-噻唑基	H
3-479	2,2,2-三氟乙基	Me	4-噻唑基	H
3-480	2,2-二氟乙基	Me	4-噻唑基	H
3-481	氧杂环丁-3-基	Me	4-噻唑基	H
3-482	环丙基甲基	Me	3-Br-Ph	H
3-483	丙-2-炔-1-基	Me	3-Br-Ph	H
3-484	丁-2-炔-1-基	Me	3-Br-Ph	H
3-485	丁-3-炔-2-基	Me	3-Br-Ph	H
3-486	Pr	Me	3-Br-Ph	H
3-487	iPr	Me	3-Br-Ph	H
3-488	CH ₂ Ph	Me	3-Br-Ph	H
3-489	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	3-Br-Ph	H
3-490	(1-甲基环丙基)甲基	Me	3-Br-Ph	H
3-491	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	3-Br-Ph	H
3-492	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	3-Br-Ph	H

3-493	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	3-Br-Ph	H
3-494	1-环丙基乙基	Me	3-Br-Ph	H
3-495	烯丙基	Me	3-Br-Ph	H
3-496	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	3-Br-Ph	H
3-497	环丁基甲基	Me	3-Br-Ph	H
3-498	环戊基甲基	Me	3-Br-Ph	H
3-499	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	3-Br-Ph	H

[0854]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-500	四氢呋喃-2-基甲基	Me	3-Br-Ph	H
3-501	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	3-Br-Ph	H
3-502	2,2,2-三氟乙基	Me	3-Br-Ph	H
3-503	2,2-二氟乙基	Me	3-Br-Ph	H
3-504	氧杂环丁-3-基	Me	3-Br-Ph	H
3-505	Et	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-506	环丙基甲基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-507	丙-2-炔-1-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-508	丁-2-炔-1-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-509	丁-3-炔-2-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-510	Pr	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-511	iPr	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-512	CH ₂ Ph	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-513	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-514	(1-甲基环丙基)甲基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-515	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-516	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-517	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-518	1-环丙基乙基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-519	烯丙基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-520	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-521	环丁基甲基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-522	环戊基甲基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-523	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-524	四氢呋喃-2-基甲基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-525	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-526	2,2,2-三氟乙基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-527	2,2-二氟乙基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-528	氧杂环丁-3-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-529	Et	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-530	环丙基甲基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-531	丙-2-炔-1-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-532	丁-2-炔-1-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-533	丁-3-炔-2-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-534	Pr	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-535	iPr	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-536	CH ₂ Ph	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-537	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-538	(1-甲基环丙基)甲基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H

[0855]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-539	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H

3-540	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-541	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-542	1-环丙基乙基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-543	烯丙基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-544	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-545	环丁基甲基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-546	环戊基甲基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-547	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-548	四氢呋喃-2-基甲基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-549	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-550	2,2,2-三氟乙基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-551	2,2-二氟乙基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-552	氧杂环丁-3-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-553	环丙基甲基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-554	丙-2-炔-1-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-555	丁-2-炔-1-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-556	丁-3-炔-2-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-557	Pr	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-558	iPr	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-559	CH ₂ Ph	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-560	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-561	(1-甲基环丙基)甲基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-562	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-563	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-564	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-565	1-环丙基乙基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-566	烯丙基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-567	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-568	环丁基甲基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-569	环戊基甲基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-570	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-571	四氢呋喃-2-基甲基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-572	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-573	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-574	2,2-二氟乙基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-575	氧杂环丁-3-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-576	环丙基甲基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-577	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H

[0856]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-578	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-579	丁-3-炔-2-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-580	Pr	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-581	iPr	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-582	CH ₂ Ph	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-583	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-584	(1-甲基环丙基)甲基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-585	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-586	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-587	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-588	1-环丙基乙基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-589	烯丙基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H

3-590	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-591	环丁基甲基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-592	环戊基甲基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-593	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-594	四氢呋喃-2-基甲基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-595	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-596	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-597	2,2-二氟乙基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-598	氧杂环丁-3-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-599	Et	Me	5-OSO ₂ Me-吡啶-2-基	H
3-600	环丙基甲基	Me	5-OSO ₂ Me-吡啶-2-基	H
3-601	丙-2-炔-1-基	Me	5-OSO ₂ Me-吡啶-2-基	H
3-602	丁-3-炔-2-基	Me	5-OSO ₂ Me-吡啶-2-基	H
3-603	iPr	Me	5-OSO ₂ Me-吡啶-2-基	H
3-604	CH ₂ Ph	Me	5-OSO ₂ Me-吡啶-2-基	H
3-605	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	5-OSO ₂ Me-吡啶-2-基	H
3-606	烯丙基	Me	5-OSO ₂ Me-吡啶-2-基	H
3-607	2,2,2-三氟乙基	Me	5-OSO ₂ Me-吡啶-2-基	H
3-608	2,2-二氟乙基	Me	5-OSO ₂ Me-吡啶-2-基	H
3-609	氧杂环丁-3-基	Me	5-OSO ₂ Me-吡啶-2-基	H
3-610	Et	Me	6-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-611	环丙基甲基	Me	6-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-612	丙-2-炔-1-基	Me	6-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-613	丁-3-炔-2-基	Me	6-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-614	iPr	Me	6-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-615	CH ₂ Ph	Me	6-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-616	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	6-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H

[0857]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-617	烯丙基	Me	6-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-618	2,2,2-三氟乙基	Me	6-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-619	2,2-二氟乙基	Me	6-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-620	氧杂环丁-3-基	Me	6-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-621	Et	Me	6-Br-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-622	环丙基甲基	Me	6-Br-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-623	丙-2-炔-1-基	Me	6-Br-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-624	丁-3-炔-2-基	Me	6-Br-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-625	iPr	Me	6-Br-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-626	CH ₂ Ph	Me	6-Br-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-627	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	6-Br-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-628	烯丙基	Me	6-Br-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-629	2,2,2-三氟乙基	Me	6-Br-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-630	2,2-二氟乙基	Me	6-Br-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-631	氧杂环丁-3-基	Me	6-Br-1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-632	Et	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-633	环丙基甲基	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-634	丙-2-炔-1-基	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-635	丁-3-炔-2-基	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-636	iPr	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-637	CH ₂ Ph	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-638	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H
3-639	烯丙基	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H

3-640	2,2,2-三氟乙基	Me	1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-641	2,2-二氟乙基	Me	1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-642	氧杂环丁-3-基	Me	1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-643	Et	Me	6-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-644	环丙基甲基	Me	6-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-645	丙-2-炔-1-基	Me	6-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-646	丁-3-炔-2-基	Me	6-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-647	iPr	Me	6-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-648	CH ₂ Ph	Me	6-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-649	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	6-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-650	烯丙基	Me	6-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-651	2,2,2-三氟乙基	Me	6-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-652	2,2-二氟乙基	Me	6-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-653	氧杂环丁-3-基	Me	6-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-654	Et	Me	6-Br-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-655	环丙基甲基	Me	6-Br-1,3-苯并噁唑-2-基	H

[0858]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-656	丙-2-炔-1-基	Me	6-Br-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-657	丁-3-炔-2-基	Me	6-Br-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-658	iPr	Me	6-Br-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-659	CH ₂ Ph	Me	6-Br-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-660	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	6-Br-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-661	烯丙基	Me	6-Br-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-662	2,2,2-三氟乙基	Me	6-Br-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-663	2,2-二氟乙基	Me	6-Br-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-664	氧杂环丁-3-基	Me	6-Br-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-665	Et	Me	7-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-666	环丙基甲基	Me	7-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-667	丙-2-炔-1-基	Me	7-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-668	丁-3-炔-2-基	Me	7-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-669	iPr	Me	7-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-670	CH ₂ Ph	Me	7-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-671	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	7-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-672	烯丙基	Me	7-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-673	2,2,2-三氟乙基	Me	7-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-674	2,2-二氟乙基	Me	7-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-675	氧杂环丁-3-基	Me	7-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
3-676	环丙基甲基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-677	丙-2-炔-1-基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-678	丁-3-炔-2-基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-679	iPr	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-680	CH ₂ Ph	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-681	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-682	烯丙基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-683	2,2,2-三氟乙基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-684	2,2-二氟乙基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-685	氧杂环丁-3-基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-686	Et	Me	5-NH ₂ -吡啶-2-基	H
3-687	环丙基甲基	Me	5-NH ₂ -吡啶-2-基	H
3-688	丙-2-炔-1-基	Me	5-NH ₂ -吡啶-2-基	H
3-689	CH ₂ Ph	Me	5-NH ₂ -吡啶-2-基	H

3-690	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	5-NH ₂ -吡啶-2-基	H
3-691	2,2,2-三氟乙基	Me	5-NH ₂ -吡啶-2-基	H
3-692	2,2-二氟乙基	Me	5-NH ₂ -吡啶-2-基	H
3-693	氧杂环丁-3-基	Me	5-NH ₂ -吡啶-2-基	H
3-694	Et	Me	5-OH-吡啶-2-基	H

[0859]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-695	环丙基甲基	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
3-696	丙-2-炔-1-基	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
3-697	CH ₂ Ph	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
3-698	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
3-699	2,2,2-三氟乙基	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
3-700	2,2-二氟乙基	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
3-701	氧杂环丁-3-基	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
3-702	Et	Me	5-OCHF ₂ -吡啶-2-基	H
3-703	环丙基甲基	Me	5-OCHF ₂ -吡啶-2-基	H
3-704	丙-2-炔-1-基	Me	5-OCHF ₂ -吡啶-2-基	H
3-705	CH ₂ Ph	Me	5-OCHF ₂ -吡啶-2-基	H
3-706	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	5-OCHF ₂ -吡啶-2-基	H
3-707	2,2,2-三氟乙基	Me	5-OCHF ₂ -吡啶-2-基	H
3-708	2,2-二氟乙基	Me	5-OCHF ₂ -吡啶-2-基	H
3-709	氧杂环丁-3-基	Me	5-OCHF ₂ -吡啶-2-基	H
3-710	Et	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
3-711	环丙基甲基	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
3-712	丙-2-炔-1-基	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
3-713	CH ₂ Ph	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
3-714	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
3-715	2,2,2-三氟乙基	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
3-716	2,2-二氟乙基	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
3-717	氧杂环丁-3-基	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
3-718	Et	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-719	环丙基甲基	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-720	丙-2-炔-1-基	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-721	CH ₂ Ph	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-722	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-723	2,2,2-三氟乙基	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-724	2,2-二氟乙基	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-725	氧杂环丁-3-基	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-726	Et	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
3-727	环丙基甲基	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
3-728	丙-2-炔-1-基	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
3-729	CH ₂ Ph	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
3-730	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
3-731	2,2,2-三氟乙基	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
3-732	2,2-二氟乙基	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
3-733	氧杂环丁-3-基	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H

[0860]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-734	Et	Me	5-NMe ₂ -吡啶-2-基	H
3-735	环丙基甲基	Me	5-NMe ₂ -吡啶-2-基	H
3-736	丙-2-炔-1-基	Me	5-NMe ₂ -吡啶-2-基	H

3-737	CH ₂ Ph	Me	5-NMe ₂ -吡啶-2-基	H
3-738	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	5-NMe ₂ -吡啶-2-基	H
3-739	2,2,2-三氟乙基	Me	5-NMe ₂ -吡啶-2-基	H
3-740	2,2-二氟乙基	Me	5-NMe ₂ -吡啶-2-基	H
3-741	氧杂环丁-3-基	Me	5-NMe ₂ -吡啶-2-基	H
3-742	3-羟基丁-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-743	3-羟基丁-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-744	3-羟基丁-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-745	3-羟基丁-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-746	3-羟基丁-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-747	3-羟基丁-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-748	3-乙基戊-1-炔-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-749	3-乙基戊-1-炔-3-基	Me	4-Br-Ph	H
3-750	3-乙基戊-1-炔-3-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-751	3-乙基戊-1-炔-3-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-752	3-乙基戊-1-炔-3-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-753	3-乙基戊-1-炔-3-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-754	二氟甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-755	二氟甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-756	二氟甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-757	二氟甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-758	二氟甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-759	二氟甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-760	2,2,3,3-四氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-761	2,2,3,3-四氟丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-762	2,2,3,3-四氟丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-763	2,2,3,3-四氟丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-764	2,2,3,3-四氟丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-765	2,2,3,3-四氟丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-766	4,4,4-三氟丁基	Me	4-Cl-Ph	H
3-767	4,4,4-三氟丁基	Me	4-Br-Ph	H
3-768	4,4,4-三氟丁基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-769	4,4,4-三氟丁基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-770	4,4,4-三氟丁基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-771	4,4,4-三氟丁基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-772	乙酰氧基甲基	Me	4-Cl-Ph	H

[0861]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-773	乙酰氧基甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-774	乙酰氧基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-775	乙酰氧基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-776	乙酰氧基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-777	乙酰氧基甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-778	2-氯代乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-779	2-氯代乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-780	2-氯代乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-781	2-氯代乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-782	2-氯代乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-783	2-氯代乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-784	3-氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-785	3-氟丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-786	3-氟丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H

3-787	3- 氟丙基	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
3-788	3- 氟丙基	Me	5-Cl-2- 噻吩基	H
3-789	3- 氟丙基	Me	5-Br-2- 噻吩基	H
3-790	2- 乙氧基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-791	2- 乙氧基乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-792	2- 乙氧基乙基	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
3-793	2- 乙氧基乙基	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
3-794	2- 乙氧基乙基	Me	5-Cl-2- 噻吩基	H
3-795	2- 乙氧基乙基	Me	5-Br-2- 噻吩基	H
3-796	2- 丙醇 -1- 基	Me	4-Cl-Ph	H
3-797	2- 丙醇 -1- 基	Me	4-Br-Ph	H
3-798	1- 羟基丙 -2- 基	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
3-799	1- 羟基丙 -2- 基	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
3-800	1- 羟基丙 -2- 基	Me	5-Cl-2- 噻吩基	H
3-801	1- 羟基丙 -2- 基	Me	5-Br-2- 噻吩基	H
3-802	2- 甲氧基丁 -1- 基	Me	4-Cl-Ph	H
3-803	2- 甲氧基丁 -1- 基	Me	4-Br-Ph	H
3-804	2- 甲氧基丁 -1- 基	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
3-805	2- 甲氧基丁 -1- 基	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
3-806	2- 甲氧基丁 -1- 基	Me	5-Cl-2- 噻吩基	H
3-807	2- 甲氧基丁 -1- 基	Me	5-Br-2- 噻吩基	H
3-808	1,3- 二氟丙 -2- 基	Me	4-Cl-Ph	H
3-809	1,3- 二氟丙 -2- 基	Me	4-Br-Ph	H
3-810	1,3- 二氟丙 -2- 基	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
3-811	1,3- 二氟丙 -2- 基	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H

[0862]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-812	1,3- 二氟丙 -2- 基	Me	5-Cl-2- 噻吩基	H
3-813	1,3- 二氟丙 -2- 基	Me	5-Br-2- 噻吩基	H
3-814	2,3- 二甲氧基丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-815	2,3- 二甲氧基丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-816	2,3- 二甲氧基丙基	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
3-817	2,3- 二甲氧基丙基	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
3-818	2,3- 二甲氧基丙基	Me	5-Cl-2- 噻吩基	H
3-819	2,3- 二甲氧基丙基	Me	5-Br-2- 噻吩基	H
3-820	1,3- 二氧戊环 -4- 基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-821	1,3- 二氧戊环 -4- 基甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-822	1,3- 二氧戊环 -4- 基甲基	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
3-823	1,3- 二氧戊环 -4- 基甲基	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
3-824	1,3- 二氧戊环 -4- 基甲基	Me	5-Cl-2- 噻吩基	H
3-825	1,3- 二氧戊环 -4- 基甲基	Me	5-Br-2- 噻吩基	H
3-826	1,1,1,4,4,4- 六氟丁 -2- 基	Me	4-Cl-Ph	H
3-827	1,1,1,4,4,4- 六氟丁 -2- 基	Me	4-Br-Ph	H
3-828	1,1,1,4,4,4- 六氟丁 -2- 基	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
3-829	1,1,1,4,4,4- 六氟丁 -2- 基	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
3-830	1,1,1,4,4,4- 六氟丁 -2- 基	Me	5-Cl-2- 噻吩基	H
3-831	1,1,1,4,4,4- 六氟丁 -2- 基	Me	5-Br-2- 噻吩基	H
3-832	1,1- 二氟丙 -2- 基	Me	4-Cl-Ph	H
3-833	1,1- 二氟丙 -2- 基	Me	4-Br-Ph	H
3-834	1,1- 二氟丙 -2- 基	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
3-835	1,1- 二氟丙 -2- 基	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
3-836	1,1- 二氟丙 -2- 基	Me	5-Cl-2- 噻吩基	H

3-837	1,1-二氟丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-838	1-氟丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-839	1-氟丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-840	1-氟丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-841	1-氟丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-842	1-氟丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-843	1-氟丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-844	1-溴代丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-845	1-溴代丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-846	1-溴代丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-847	1-溴代丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-848	1-溴代丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-849	1-溴代丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-850	1-氯代丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H

[0863]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-851	1-氯代丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-852	1-氯代丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-853	1-氯代丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-854	1-氯代丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-855	1-氯代丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-856	2-异丙氧基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-857	2-异丙氧基乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-858	2-异丙氧基乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-859	2-异丙氧基乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-860	2-异丙氧基乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-861	2-异丙氧基乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-862	四氢呋喃-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-863	四氢呋喃-3-基	Me	4-Br-Ph	H
3-864	四氢呋喃-3-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-865	四氢呋喃-3-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-866	四氢呋喃-3-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-867	四氢呋喃-3-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-868	2-(2,2,2-三氟乙氧基)乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-869	2-(2,2,2-三氟乙氧基)乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-870	2-(2,2,2-三氟乙氧基)乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-871	2-(2,2,2-三氟乙氧基)乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-872	2-(2,2,2-三氟乙氧基)乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-873	2-(2,2,2-三氟乙氧基)乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-874	(3,3,4,4,4-五氟丁-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-875	(3,3,4,4,4-五氟丁-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-876	(3,3,4,4,4-五氟丁-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-877	(3,3,4,4,4-五氟丁-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-878	(3,3,4,4,4-五氟丁-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-879	(3,3,4,4,4-五氟丁-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-880	1-(N,N-二甲基氨基羰基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-881	1-(N,N-二甲基氨基羰基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-882	1-(N,N-二甲基氨基羰基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-883	1-(N,N-二甲基氨基羰基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-884	1-(N,N-二甲基氨基羰基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-885	1-(N,N-二甲基氨基羰基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-886	(1,3-二噁烷-2-基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H

3-887	(1,3-二噁烷-2-基)甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-888	(1,3-二噁烷-2-基)甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-889	(1,3-二噁烷-2-基)甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

[0864]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-890	(1,3-二噁烷-2-基)甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-891	(1,3-二噁烷-2-基)甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-892	1,1,1-三氟丁-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-893	1,1,1-三氟丁-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-894	1,1,1-三氟丁-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-895	1,1,1-三氟丁-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-896	1,1,1-三氟丁-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-897	1,1,1-三氟丁-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-898	2-(次丁-2-基氨基氧基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-899	2-(次丁-2-基氨基氧基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-900	2-(次丁-2-基氨基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-901	2-(次丁-2-基氨基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-902	2-(次丁-2-基氨基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-903	2-(次丁-2-基氨基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-904	氧杂环丁-2-基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-905	氧杂环丁-2-基甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-906	氧杂环丁-2-基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-907	氧杂环丁-2-基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-908	氧杂环丁-2-基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-909	氧杂环丁-2-基甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-910	2,2-二甲氧基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-911	2,2-二甲氧基乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-912	2,2-二甲氧基乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-913	2,2-二甲氧基乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-914	2,2-二甲氧基乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-915	2,2-二甲氧基乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-916	1-氯代丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-917	1-氯代丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-918	1-氯代丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-919	1-氯代丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-920	1-氯代丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-921	1-氯代丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-922	4-氯代丁-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-923	4-氯代丁-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-924	4-氯代丁-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-925	4-氯代丁-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-926	4-氯代丁-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-927	4-氯代丁-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-928	3-氯代丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H

[0865]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-929	3-氯代丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-930	3-氯代丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-931	3-氯代丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-932	3-氯代丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-933	3-氯代丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H

3-934	2-(2-氯代乙氧基)乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-935	2-(2-氯代乙氧基)乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-936	2-(2-氯代乙氧基)乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-937	2-(2-氯代乙氧基)乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-938	2-(2-氯代乙氧基)乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-939	2-(2-氯代乙氧基)乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-940	2,2-二氯乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-941	2,2-二氯乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-942	2,2-二氯乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-943	2,2-二氯乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-944	2,2-二氯乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-945	2,2-二氯乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-946	2,3-二氯丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-947	2,3-二氯丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-948	2,3-二氯丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-949	2,3-二氯丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-950	2,3-二氯丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-951	2,3-二氯丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-952	1,3-二氯丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-953	1,3-二氯丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-954	1,3-二氯丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-955	1,3-二氯丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-956	1,3-二氯丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-957	1,3-二氯丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-958	2-氯 2,2-二氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-959	2-氯 2,2-二氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-960	2-氯 2,2-二氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-961	2-氯 2,2-二氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-962	2-氯 2,2-二氟乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-963	2-氯 2,2-二氟乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-964	1-氯 2-甲基丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-965	1-氯 2-甲基丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-966	1-氯 2-甲基丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-967	1-氯 2-甲基丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

[0866]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-968	1-氯 2-甲基丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-969	1-氯 2-甲基丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-970	1-氟-3-甲氧基丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-971	1-氟-3-甲氧基丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-972	1-氟-3-甲氧基丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-973	1-氟-3-甲氧基丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-974	1-氟-3-甲氧基丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-975	1-氟-3-甲氧基丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-976	3,3,3-三氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-977	3,3,3-三氟丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-978	3,3,3-三氟丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-979	3,3,3-三氟丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-980	3,3,3-三氟丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-981	3,3,3-三氟丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-982	2-氯苯基	Me	4-Cl-Ph	H

3-983	2-氯苯基	Me	4-Br-Ph	H
3-984	2-氯苯基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-985	2-氯苯基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-986	2-氯苯基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-987	2-氯苯基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-988	2-氯代吡啶-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-989	2-氯代吡啶-3-基	Me	4-Br-Ph	H
3-990	2-氯代吡啶-3-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-991	2-氯代吡啶-3-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-992	2-氯代吡啶-3-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-993	2-氯代吡啶-3-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-994	3-氯代吡啶-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-995	3-氯代吡啶-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-996	3-氯代吡啶-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-997	3-氯代吡啶-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-998	3-氯代吡啶-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-999	3-氯代吡啶-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1000	五氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1001	五氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1002	五氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1003	五氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1004	五氟乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1005	五氟乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1006	1,2,2,2-四氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H

[0867]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-1007	1,2,2,2-四氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1008	1,2,2,2-四氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1009	1,2,2,2-四氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1010	1,2,2,2-四氟乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1011	1,2,2,2-四氟乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1012	1,1,2,2-四氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1013	1,1,2,2-四氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1014	1,1,2,2-四氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1015	1,1,2,2-四氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1016	1,1,2,2-四氟乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1017	1,1,2,2-四氟乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1018	1,1,2-三氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1019	1,1,2-三氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1020	1,1,2-三氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1021	1,1,2-三氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1022	1,1,2-三氟乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1023	1,1,2-三氟乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1024	2-甲基丁-3-炔-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1025	2-甲基丁-3-炔-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1026	2-甲基丁-3-炔-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1027	2-甲基丁-3-炔-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1028	2-甲基丁-3-炔-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1029	2-甲基丁-3-炔-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1030	1-(乙氧基羰基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1031	1-(乙氧基羰基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H

3-1032	1-(乙氧基羰基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1033	1-(乙氧基羰基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1034	1-(乙氧基羰基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1035	1-(乙氧基羰基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1036	1,1,2,3,3,3-六氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1037	1,1,2,3,3,3-六氟丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1038	1,1,2,3,3,3-六氟丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1039	1,1,2,3,3,3-六氟丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1040	1,1,2,3,3,3-六氟丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1041	1,1,2,3,3,3-六氟丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1042	异丁基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1043	异丁基	Me	4-Br-Ph	H
3-1044	异丁基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1045	异丁基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

[0868]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-1046	异丁基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1047	异丁基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1048	n-戊基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1049	n-戊基	Me	4-Br-Ph	H
3-1050	n-戊基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1051	n-戊基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1052	n-戊基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1053	n-戊基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1054	n-庚基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1055	n-庚基	Me	4-Br-Ph	H
3-1056	n-庚基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1057	n-庚基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1058	n-庚基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1059	n-庚基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1060	n-壬基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1061	n-壬基	Me	4-Br-Ph	H
3-1062	n-壬基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1063	n-壬基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1064	n-壬基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1065	n-壬基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1066	环戊基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1067	环戊基	Me	4-Br-Ph	H
3-1068	环戊基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1069	环戊基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1070	环戊基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1071	环戊基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1072	环己基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1073	环己基	Me	4-Br-Ph	H
3-1074	环己基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1075	环己基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1076	环己基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1077	环己基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1078	sBu	Me	4-Cl-Ph	H
3-1079	sBu	Me	4-Br-Ph	H
3-1080	sBu	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1081	sBu	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

3-1082	sBu	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1083	sBu	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1084	戊-3-基	Me	4-Cl-Ph	H

[0869]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-1085	戊-3-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1086	戊-3-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1087	戊-3-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1088	戊-3-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1089	戊-3-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1090	1-(甲氧基羰基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1091	1-(甲氧基羰基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1092	1-(甲氧基羰基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1093	1-(甲氧基羰基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1094	1-(甲氧基羰基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1095	1-(甲氧基羰基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1096	2,2,2-三氯代乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1097	2,2,2-三氯代乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1098	2,2,2-三氯代乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1099	2,2,2-三氯代乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1100	2,2,2-三氯代乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1101	2,2,2-三氯代乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1102	3-氯代丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1103	3-氯代丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1104	3-氯代丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1105	3-氯代丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1106	3-氯代丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1107	3-氯代丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1108	2-(2-甲氧基乙氧基)乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1109	2-(2-甲氧基乙氧基)乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1110	2-(2-甲氧基乙氧基)乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1111	2-(2-甲氧基乙氧基)乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1112	2-(2-甲氧基乙氧基)乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1113	2-(2-甲氧基乙氧基)乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1114	丁基-2-基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1115	丁基-2-基甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1116	丁基-2-基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1117	丁基-2-基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1118	丁基-2-基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1119	丁基-2-基甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1120	丁-3-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1121	丁-3-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1122	丁-3-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1123	丁-3-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

[0870]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-1124	丁-3-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1125	丁-3-炔-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1126	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1127	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1128	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H

3-1129	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1130	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1131	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1132	2-(N,N-二乙基氨基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1133	2-(N,N-二乙基氨基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1134	2-(N,N-二乙基氨基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1135	2-(N,N-二乙基氨基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1136	2-(N,N-二乙基氨基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1137	2-(N,N-二乙基氨基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1138	2-羧基苯基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1139	2-羧基苯基	Me	4-Br-Ph	H
3-1140	2-羧基苯基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1141	2-羧基苯基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1142	2-羧基苯基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1143	2-羧基苯基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1144	叔丁基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1145	tBu	Me	4-Br-Ph	H
3-1146	tBu	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1147	tBu	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1148	tBu	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1149	tBu	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1150	1-甲基环丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1151	1-甲基环丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1152	1-甲基环丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1153	1-甲基环丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1154	1-甲基环丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1155	1-甲基环丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1156	三甲基甲硅烷基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1157	三甲基甲硅烷基甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1158	三甲基甲硅烷基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1159	三甲基甲硅烷基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1160	三甲基甲硅烷基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1161	三甲基甲硅烷基甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1162	2,3-二氢-1H-茚-5-基	Me	4-Cl-Ph	H

[0871]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-1163	2,3-二氢-1H-茚-5-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1164	2,3-二氢-1H-茚-5-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1165	2,3-二氢-1H-茚-5-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1166	2,3-二氢-1H-茚-5-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1167	2,3-二氢-1H-茚-5-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1168	1-甲基环丁基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1169	1-甲基环丁基	Me	4-Br-Ph	H
3-1170	1-甲基环丁基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1171	1-甲基环丁基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1172	1-甲基环丁基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1173	1-甲基环丁基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1174	2-(氧杂环丁-3-基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1175	2-(氧杂环丁-3-基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1176	2-(氧杂环丁-3-基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1177	2-(氧杂环丁-3-基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

3-1178	2-(氧杂环丁-3-基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1179	2-(氧杂环丁-3-基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1180	Bu	Me	4-Cl-Ph	H
3-1181	Bu	Me	4-Br-Ph	H
3-1182	Bu	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1183	Bu	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1184	Bu	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1185	Bu	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1186	2-(N,N-二乙基氨基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1187	2-(N,N-二乙基氨基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1188	2-(N,N-二乙基氨基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1189	2-(N,N-二乙基氨基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1190	2-(N,N-二乙基氨基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1191	2-(N,N-二乙基氨基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1192	2-(吗啉-4-基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1193	2-(吗啉-4-基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1194	2-(吗啉-4-基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1195	2-(吗啉-4-基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1196	2-(吗啉-4-基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1197	2-(吗啉-4-基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1198	2-氯代噻吩-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1199	2-氯代噻吩-3-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1200	2-氯代噻吩-3-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1201	2-氯代噻吩-3-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

[0872]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-1202	2-氯代噻吩-3-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1203	2-氯代噻吩-3-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1204	(N,N-二甲基氨基羰基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1205	(N,N-二甲基氨基羰基)甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1206	(N,N-二甲基氨基羰基)甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1207	(N,N-二甲基氨基羰基)甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1208	(N,N-二甲基氨基羰基)甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1209	(N,N-二甲基氨基羰基)甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1210	1-(t-丁基羰基氧基)-2-甲基丙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1211	1-(t-丁基羰基氧基)-2-甲基丙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1212	1-(t-丁基羰基氧基)-2-甲基丙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1213	1-(t-丁基羰基氧基)-2-甲基丙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1214	1-(t-丁基羰基氧基)-2-甲基丙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1215	1-(t-丁基羰基氧基)-2-甲基丙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1216	(5-甲基-2-氧代-1,3-二氧杂环戊烯-4-基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1217	(5-甲基-2-氧代-1,3-二氧杂环戊烯-4-基)甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1218	(5-甲基-2-氧代-1,3-二氧杂环戊烯-4-基)甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1219	(5-甲基-2-氧代-1,3-二氧杂环戊烯-4-基)甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1220	(5-甲基-2-氧代-1,3-二氧杂环戊烯-4-基)甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1221	(5-甲基-2-氧代-1,3-二氧杂环戊烯-4-基)甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1222	[(叔丁氧基羰基)氧基]甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1223	[(叔丁氧基羰基)氧基]甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1224	[(叔丁氧基羰基)氧基]甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1225	[(叔丁氧基羰基)氧基]甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1226	[(叔丁氧基羰基)氧基]甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1227	[(叔丁氧基羰基)氧基]甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1228	[(异丙氧基羰基)氧基]甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1229	[(异丙氧基羰基)氧基]甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1230	[(异丙氧基羰基)氧基]甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1231	[(异丙氧基羰基)氧基]甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1232	[(异丙氧基羰基)氧基]甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1233	[(异丙氧基羰基)氧基]甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1234	[(甲氧基羰基)氧基]甲基	Me	4-Cl-Ph	H

3-1235	[(甲氧基羰基)氧基]甲基	Me	4-Br-Ph	H
--------	---------------	----	---------	---

[0873]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-1236	[(甲氧基羰基)氧基]甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1237	[(甲氧基羰基)氧基]甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

3-1238	[(甲氧基羰基)氧基]甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1239	[(甲氧基羰基)氧基]甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1240	1-[(乙氧基羰基)氧基]乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1241	1-[(乙氧基羰基)氧基]乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1242	1-[(乙氧基羰基)氧基]乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1243	1-[(乙氧基羰基)氧基]乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1244	1-[(乙氧基羰基)氧基]乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1245	1-[(乙氧基羰基)氧基]乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1246	1-乙酰氧基乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1247	1-乙酰氧基乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1248	1-乙酰氧基乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1249	1-乙酰氧基乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1250	1-乙酰氧基乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1251	1-乙酰氧基乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1252	1-(2-甲基丙酰基氧基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1253	1-(2-甲基丙酰基氧基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1254	1-(2-甲基丙酰基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1255	1-(2-甲基丙酰基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1256	1-(2-甲基丙酰基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1257	1-(2-甲基丙酰基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1258	1-丙酰基-2-甲基丙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1259	1-丙酰基-2-甲基丙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1260	1-丙酰基-2-甲基丙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1261	1-丙酰基-2-甲基丙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1262	1-丙酰基-2-甲基丙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1263	1-丙酰基-2-甲基丙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1264	1-(环己氧基羰基氧基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1265	1-(环己氧基羰基氧基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1266	1-(环己氧基羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1267	1-(环己氧基羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1268	1-(环己氧基羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1269	1-(环己氧基羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1270	环丁基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1271	环丁基	Me	4-Br-Ph	H
3-1272	环丁基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1273	环丁基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1274	环丁基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H

[0874]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-1275	环丁基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1276	CH ₂ (4-Me-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
3-1277	CH ₂ (4-Me-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
3-1278	CH ₂ (4-Me-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1279	CH ₂ (4-Me-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1280	CH ₂ (4-Me-Ph)	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1281	CH ₂ (4-Me-Ph)	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1282	CHMe(4-Cl-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
3-1283	CHMe(4-Cl-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
3-1284	CHMe(4-Cl-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1285	CHMe(4-Cl-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1286	CHMe(4-Cl-Ph)	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1287	CHMe(4-Cl-Ph)	Me	5-Br-2-噻吩基	H

3-1288	CHMePh	Me	4-Cl-Ph	H
3-1289	CHMePh	Me	4-Br-Ph	H
3-1290	CHMePh	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1291	CHMePh	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1292	CHMePh	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1293	CHMePh	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1294	1,1,1-三氟丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1295	1,1,1-三氟丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1296	1,1,1-三氟丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1297	1,1,1-三氟丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1298	1,1,1-三氟丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1299	1,1,1-三氟丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1300	(1-乙基-3-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1301	(1-乙基-3-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1302	(1-乙基-3-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1303	(1-乙基-3-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1304	(1-乙基-3-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1305	(1-乙基-3-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1306	Pr	Me	4-Cl-Ph	H
3-1307	Pr	Me	4-Br-Ph	H
3-1308	Pr	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1309	Pr	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1310	Pr	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1311	Pr	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1312	n-十八烷基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1313	n-十八烷基	Me	4-Br-Ph	H

[0875]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-1314	n-十八烷基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1315	n-十八烷基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1316	n-十八烷基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1317	n-十八烷基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1318	n-十六烷基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1319	n-十六烷基	Me	4-Br-Ph	H
3-1320	n-十六烷基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1321	n-十六烷基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1322	n-十六烷基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1323	n-十六烷基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1324	氧杂环丁-3-基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1325	氧杂环丁-3-基甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1326	氧杂环丁-3-基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1327	氧杂环丁-3-基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1328	氧杂环丁-3-基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1329	氧杂环丁-3-基甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1330	3-甲基氧杂环丁-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1331	3-甲基氧杂环丁-3-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1332	3-甲基氧杂环丁-3-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1333	3-甲基氧杂环丁-3-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1334	3-甲基氧杂环丁-3-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1335	3-甲基氧杂环丁-3-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1336	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1337	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Br-Ph	H

3-1338	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1339	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1340	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1341	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1342	(3E)-戊-3-烯-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1343	(3E)-戊-3-烯-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1344	(3E)-戊-3-烯-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1345	(3E)-戊-3-烯-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1346	(3E)-戊-3-烯-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1347	(3E)-戊-3-烯-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1348	(2,2-二甲基丙酰基氧基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1349	(2,2-二甲基丙酰基氧基)甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1350	(2,2-二甲基丙酰基氧基)甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1351	(2,2-二甲基丙酰基氧基)甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1352	(2,2-二甲基丙酰基氧基)甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H

[0876]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
3-1353	(2,2-二甲基丙酰基氧基)甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1354	2-(异丙氧基羰基氧基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1355	2-(异丙氧基羰基氧基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1356	2-(异丙氧基羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1357	2-(异丙氧基羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1358	2-(异丙氧基羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1359	2-(异丙氧基羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H

[0877] 此外,还生成了本发明的通式(I)化合物的NMR数据。示例性化合物的NMR各自以在400MHz(CDCl₃)下的¹H-NMR谱(¹H核磁共振数据)记录。一些示例性化合物的特征化学位移δ(ppm)如下所列:

[0878] NMR化合物3-135(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0879] 0.28(m,2H);0.58(m,2H);1.12(m,1H);2.40(s,3H);3.54(s,2H);3.95(d,2H);7.52(d,1H);7.78(dd,1H);8.52(d,1H);8.65(s,2H);9.09(s,1H)。

[0880] NMR化合物3-353(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0881] 2.38(s,3H);3.62(s,2H);4.32(txd,2H);5.95(txt,1H);7.33(d,1H);7.75(dd,1H);8.58(d,1H);8.67(s,2H);9.10(s,1H)。

[0882] NMR化合物3-112(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0883] 2.38(s,3H);2.49(t,1H);3.60(s,2H);4.70(d,2H);7.41(d,1H);7.74(dd,1H);8.54(d,1H);8.65(s,2H);9.08(s,1H)。

[0884] NMR化合物3-25(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0885] 1.26(t,3H);2.38(s,3H);3.52(s,2H);4.16(q,2H);7.49(d,1H);7.77(dd,1H);8.53(d,1H);8.65(s,2H);9.08(s,1H)。

[0886] NMR化合物3-26(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0887] 1.28(t,3H);2.38(s,3H);3.51(s,2H);4.17(q,2H);7.41(d,1H);7.91(dd,1H);8.63(d,1H);8.64(s,2H);9.09(s,1H)。

[0888] NMR化合物3-136(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0889] 0.28(m,2H);0.58(m,2H);1.12(m,1H);2.40(s,3H);3.52(s,2H);3.97(d,2H);

7. 43(d, 1H) ;7. 91(dd, 1H) ;8. 63(d, 1H) ;8. 65(s, 2H) ;9. 08(s, 1H)。

[0890] NMR 化合物 3-176(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0891] 1. 82(s, 3H) ;2. 38(s, 3H) ;3. 59(s, 2H) ;4. 22(s, 2H) ;7. 48(d, 1H) ;7. 90(dd, 1H) ;8. 64(d, 1H) ;8. 65(s, 2H) ;9. 09(s, 1H)。

[0892] NMR 化合物 3-161(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0893] 1. 85(s, 3H) ;2. 38(s, 3H) ;3. 42(s, 2H) ;4. 22(s, 2H) ;7. 21(d, 2H) ;7. 40(d, 2H) ;8. 62(s, 2H) ;9. 04(s, 1H)。

[0894] NMR 化合物 3-121(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

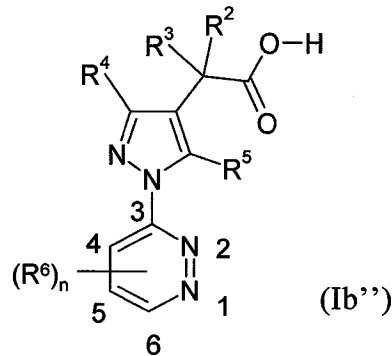
[0895] 0. 29(m, 2H) ;0. 59(m, 2H) ;1. 12(m, 1H) ;2. 39(s, 3H) ;3. 40(s, 2H) ;3. 92(d, 2H) ;7. 21(d, 2H) ;7. 40(d, 2H) ;8. 62(s, 2H) ;9. 03(s, 1H)。

[0896] NMR 化合物 3-4(CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm) :

[0897] 1. 27(t, 3H) ;2. 38(s, 3H) ;3. 38(s, 2H) ;4. 17(q, 2H) ;7. 20(d, 2H) ;7. 40(d, 2H) ;8. 62(s, 2H) ;9. 03(s, 1H)。

[0898] 表 4 :式 (Ib'') 的化合物

[0899]



[0900]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
4-1	H	H	Ph	Ph	H
4-2	H	H	Me	Ph	H

[0901]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
4-3	H	H	Me	5-I-2-噻吩基	H
4-4	H	H	Me	2-咪喃基	H
4-5	H	H	Me	Ph	6-OMe
4-6	Me	H	Me	Ph	4-Me
4-7	H	H	Me	Ph	6-Cl
4-8	H	H	Me	Ph	4-CF ₃
4-9	H	H	Me	Ph	6-CF ₃
4-10	H	H	Me	Ph	4-Me
4-11	H	H	Me	Ph	4, 6-Me ₂
4-12	H	H	Me	Ph	4, 6-Cl ₂
4-13	H	H	Me	4-MeO-Ph	4-Me
4-14	H	H	Me	4-MeO-Ph	H
4-15	Me	H	Me	Ph	H
4-16	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
4-17	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Cl
4-18	H	H	Me	4-Me-Ph	H

4-19	H	H	Me	3-Cl-Ph	H
4-20	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	H
4-21	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	4-Me
4-22	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	4-Me
4-23	H	H	Me	3-Cl-Ph	4-Me
4-24	H	H	Me	2-Cl-Ph	4-Me
4-25	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	4-Me
4-26	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	4-Me
4-27	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Me
4-28	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
4-29	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	H
4-30	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	H
4-31	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Cl
4-32	H	H	Me	Ph	4-Cl
4-33	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
4-34	H	H	Me	4-tBu-Ph	4-Me
4-35	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph	4-Me
4-36	H	H	Me	Ph	4-OMe
4-37	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-OMe
4-38	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
4-39	H	H	Me	4-F-Ph	4-Cl
4-40	H	H	Me	4-F-Ph	4-Me
4-41	H	H	Me	3-Me-Ph	4-Me

[0902]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
4-42	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	4-Me
4-43	H	H	Me	3-Br-Ph	4-Me
4-44	H	H	Me	4-Ph-Ph	4-Me
4-45	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	H
4-46	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph	H
4-47	H	H	Me	Ph	4-SMe
4-48	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SMe
4-49	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H
4-50	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	H
4-51	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	4-Me
4-52	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	4-Me
4-53	H	H	Me	2-吡啶基	4-Cl
4-54	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-F
4-55	H	H	Me	2-噻吩基	4-Me
4-56	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	4-Me
4-57	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	4-Me
4-58	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Me
4-59	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Cl
4-60	H	H	Me	3-噻吩基	4-Me
4-61	H	H	Me	2-噻吩基	H
4-62	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	H
4-63	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	H
4-64	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
4-65	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基	H
4-66	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
4-67	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	H
4-68	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	4-Me

4-69	H	H	Me	3- 噻吩基	H
4-70	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-S(O)Me
4-71	H	H	Me	4-Br-Ph	4-Me
4-72	H	H	Me	1,3- 苯并二氧杂环戊烯 -5- 基	4-Me
4-73	H	H	Me	4-I-Ph	4-Me
4-74	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	4-Me
4-75	H	H	Me	4-PhO-Ph	4-Me
4-76	H	H	Me	6-OH- 吡啶 -3- 基	H
4-77	H	H	Me	Ph	4-S(O)Me
4-78	H	H	H	Ph	H
4-79	H	H	H	Ph	4-Me
4-80	H	H	Et	Ph	H

[0903]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
4-81	H	H	n-Pr	Ph	H
4-82	H	H	CH ₂ Cl	Ph	H
4-83	H	H	CHCl ₂	Ph	H
4-84	H	H	CH ₂ F	Ph	H
4-85	H	H	CHF ₂	Ph	H
4-86	H	H	Cl	Ph	H
4-87	H	H	Et	Ph	4-Me
4-88	H	H	n-Pr	Ph	4-Me
4-89	H	H	CH ₂ Cl	Ph	4-Me
4-90	H	H	CHCl ₂	Ph	4-Me
4-91	H	H	CH ₂ F	Ph	4-Me
4-92	H	H	CHF ₂	Ph	4-Me
4-93	H	H	Cl	Ph	4-Me
4-94	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
4-95	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
4-96	H	H	CH ₂ Cl	4-Cl-Ph	H
4-97	H	H	CHCl ₂	4-Cl-Ph	H
4-98	H	H	CH ₂ F	4-Cl-Ph	H
4-99	H	H	CHF ₂	4-Cl-Ph	H
4-100	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
4-101	H	H	Et	4-Me-Ph	H
4-102	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H
4-103	H	H	CH ₂ Cl	4-Me-Ph	H
4-104	H	H	CHCl ₂	4-Me-Ph	H
4-105	H	H	CH ₂ F	4-Me-Ph	H
4-106	H	H	CHF ₂	4-Me-Ph	H
4-107	H	H	Cl	4-Me-Ph	H
4-108	H	H	Et	2- 吡啶基	H
4-109	H	H	n-Pr	2- 吡啶基	H
4-110	H	H	CH ₂ Cl	2- 吡啶基	H
4-111	H	H	CHCl ₂	2- 吡啶基	H
4-112	H	H	CH ₂ F	2- 吡啶基	H
4-113	H	H	CHF ₂	2- 吡啶基	H
4-114	H	H	Cl	2- 吡啶基	H
4-115	H	H	Me	2- 吡啶基	H
4-116	H	H	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
4-117	H	H	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	4-Cl
4-118	H	H	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	4-Me

4-119	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
-------	---	---	----	-------------	---

[0904]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
4-120	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Cl
4-121	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Me
4-122	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
4-123	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
4-124	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	4-Me
4-125	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	H
4-126	H	H	Me	4-CH ₂ COOH-Ph	4-Me
4-127	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	4-Me
4-128	H	H	Me	4-Br-Ph	H
4-129	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	H
4-130	H	H	Me	3-Me-Ph	H
4-131	H	H	Me	4-F-Ph	H
4-132	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
4-133	H	H	Me	4-tBu-Ph	H
4-134	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
4-135	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	4-Me
4-136	H	H	Me	3-吡啶基	H
4-137	H	H	Me	4-吡啶基	H
4-138	H	H	C(O)OMe	Ph	H
4-139	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
4-140	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SO ₂ Me
4-141	H	H	Me	3-吡啶基	4-Me
4-142	H	H	Me	2,3-Cl ₂ -Ph	4-Me
4-143	H	H	Me	2-吡啶基	4-Me
4-144	H	H	H	4-Cl-Ph	4-Me
4-145	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
4-146	H	H	Me	Ph	4-Me
4-147	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
4-148	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Me
4-149	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Cl
4-150	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-F
4-151	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H
4-152	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H
4-153	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
4-154	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
4-155	H	H	Me	5-CF ₃ -吡啶-2-基	H
4-156	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
4-157	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
4-158	H	H	CN	4-Cl-Ph	H

[0905]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
4-159	H	H	CN	4-Cl-Ph	4-Me
4-160	H	H	CN	4-Me-Ph	H
4-161	H	H	CN	4-Me-Ph	4-Me
4-162	H	H	CN	Ph	H
4-163	H	H	CN	Ph	4-Me
4-164	H	H	CN	2-吡啶基	H
4-165	H	H	CN	3-吡啶基	H
4-166	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H

4-167	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H
4-168	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
4-169	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H
4-170	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
4-171	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
4-172	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
4-173	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
4-174	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
4-175	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
4-176	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	H
4-177	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	4-Me
4-178	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	H
4-179	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	4-Me
4-180	H	H	甲酰基	Ph	H
4-181	H	H	甲酰基	Ph	4-Me
4-182	H	H	甲酰基	2-吡啶基	H
4-183	H	H	甲酰基	3-吡啶基	H
4-184	H	H	甲酰基	5-Cl-吡啶-2-基	H
4-185	H	H	甲酰基	5-Br-吡啶-2-基	H
4-186	H	H	甲酰基	5-F-吡啶-2-基	H
4-187	H	H	甲酰基	5-Me-吡啶-2-基	H
4-188	H	H	甲酰基	6-Me-吡啶-3-基	H
4-189	H	H	甲酰基	4-Me-吡啶-2-基	H
4-190	H	H	甲酰基	4-F-吡啶-2-基	H
4-191	H	H	甲酰基	4-Cl-吡啶-2-基	H
4-192	H	H	甲酰基	4-Br-吡啶-2-基	H
4-193	H	H	甲酰基	4-OMe-吡啶-2-基	H
4-194	H	H	CH ₂ OH	5-Me-吡啶-2-基	H
4-195	H	H	CH ₂ OH	4-Cl-Ph	H
4-196	H	H	CH ₂ OH	4-Me-吡啶-2-基	H
4-197	H	H	CH ₂ OH	4-Me-Ph	H

[0906]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
4-198	H	H	CH ₂ OH	Ph	H
4-199	H	H	CH ₂ OH	2-吡啶基	H
4-200	H	H	Me	2-噻唑基	H
4-201	H	H	Me	2-噻唑基	4-Cl
4-202	H	H	Me	2-噻唑基	4-Me
4-203	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
4-204	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Cl
4-205	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Me
4-206	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
4-207	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
4-208	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	4-Me
4-209	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
4-210	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	H
4-211	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	4-Me
4-212	H	H	Me	2-吡啶基	4-F
4-213	H	H	Me	2-吡嗪基	H
4-214	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
4-215	H	H	Me	2-吡嗪基	4-Me
4-216	H	H	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H

4-217	H	H	Me	1,3- 苯并噻唑 -2- 基	4-Me
4-218	H	H	Me	7-Cl-1,3- 苯并噻唑 -2- 基	H
4-219	H	H	Me	1,5-Me ₂ - 吡唑 -3- 基	H
4-220	H	H	Me	1,5-Me ₂ - 吡唑 -3- 基	4-Me
4-221	H	H	Me	4,5-Me ₂ - 噻唑 -2- 基	H
4-222	H	H	Me	4,5-Cl ₂ - 噻唑 -2- 基	H
4-223	H	H	Me	2- 嘧啶基	H
4-224	H	H	Me	2- 嘧啶基	4-Me
4-225	H	H	Me	5-F- 嘧啶 -2- 基	H
4-226	H	H	Me	5-Cl- 嘧啶 -2- 基	H
4-227	H	H	Me	5-Br- 嘧啶 -2- 基	H
4-228	H	H	Me	5-Me- 嘧啶 -2- 基	H
4-229	H	H	Me	5-Me- 嘧啶 -2- 基	4-Me
4-230	H	H	Me	4,6-Me ₂ - 嘧啶 -2- 基	H
4-231	H	H	Me	4,6-Me ₂ - 嘧啶 -2- 基	4-Me
4-232	H	H	Me	3- 哒嗪基	H
4-233	H	H	Me	6-Me- 哒嗪 -3- 基	H
4-234	H	H	Me	1,2,4- 三嗪 -3- 基	H
4-235	H	H	Me	6-Me-1,2,4- 三嗪 -3- 基	H
4-236	H	H	Me	2- 吡啶基	6-OMe

[0907]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
4-237	H	H	Me	2- 吡啶基	6-Cl
4-238	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	H
4-239	H	H	Me	异喹啉 -3- 基	H
4-240	H	H	Me	喹啉 -2- 基	H

[0908] 此外,还生成了本发明的通式(I)化合物的NMR数据。示例性化合物的NMR各自以在400MHz(CDCl₃)下的¹H-NMR谱(¹H核磁共振数据)记录。一些示例性化合物的特征化学位移δ(ppm)如下所列:

[0909] NMR化合物4-236(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

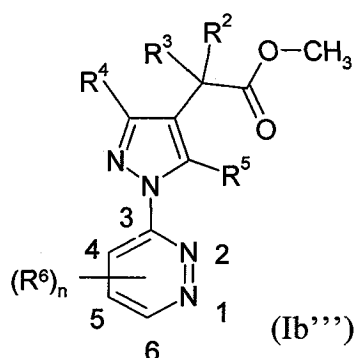
[0910] 2.42(s,3H);3.50(s,2H);4.06(s,3H);7.18(d,1H);7.58(m,1H);7.60(m,1H);7.88(brs,1H);8.01(m,1H);8.03(d,1H);8.70(m,1H)。

[0911] NMR化合物4-237(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0912] 2.43(s,3H);3.47(s,2H);7.44(m,1H);7.48(m,1H);7.64(d,1H);7.86(m,1H);8.17(d,1H);8.67(m,1H)。

[0913] 表5:式(Ib'")的化合物

[0914]



[0915]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
5-1	H	H	Ph	Ph	H
5-2	H	H	Me	Ph	H
5-3	H	H	Me	5-I-2-噻吩基	H
5-4	H	H	Me	2-咪唑基	H
5-5	H	H	Me	Ph	6-OMe
5-6	Me	H	Me	Ph	4-Me

[0916]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
5-7	H	H	Me	Ph	6-Cl
5-8	H	H	Me	Ph	4-CF ₃
5-9	H	H	Me	Ph	6-CF ₃
5-10	H	H	Me	Ph	4-Me
5-11	H	H	Me	Ph	4,6-Me ₂
5-12	H	H	Me	Ph	4,6-Cl ₂
5-13	H	H	Me	4-MeO-Ph	4-Me
5-14	H	H	Me	4-MeO-Ph	H
5-15	Me	H	Me	Ph	H
5-16	H	H	Me	4-Me-Ph	H
5-17	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
5-18	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Cl
5-19	H	H	Me	3-Cl-Ph	H
5-20	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	H
5-21	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	4-Me
5-22	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	4-Me
5-23	H	H	Me	3-Cl-Ph	4-Me
5-24	H	H	Me	2-Cl-Ph	4-Me
5-25	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	4-Me
5-26	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	4-Me
5-27	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Me
5-28	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
5-29	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	H
5-30	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	H
5-31	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Cl
5-32	H	H	Me	Ph	4-Cl
5-33	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
5-34	H	H	Me	4-tBu-Ph	4-Me
5-35	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph	4-Me
5-36	H	H	Me	Ph	4-OMe

5-37	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-OMe
5-38	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
5-39	H	H	Me	4-F-Ph	4-Me
5-40	H	H	Me	4-F-Ph	4-Cl
5-41	H	H	Me	3-Me-Ph	4-Me
5-42	H	H	Me	4-COOH-Ph	4-Me
5-43	H	H	Me	3-Br-Ph	4-Me
5-44	H	H	Me	4-Ph-Ph	4-Me
5-45	H	H	Me	4-COOH-Ph	H

[0917]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
5-46	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph	H
5-47	H	H	Me	Ph	4-SMe
5-48	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SMe
5-49	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H
5-50	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	H
5-51	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	4-Me
5-52	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	4-Me
5-53	H	H	Me	2-吡啶基	4-Cl
5-54	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-F
5-55	H	H	Me	2-噻吩基	4-Me
5-56	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	4-Me
5-57	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	4-Me
5-58	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Me
5-59	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Cl
5-60	H	H	Me	3-噻吩基	4-Me
5-61	H	H	Me	2-噻吩基	H
5-62	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	H
5-63	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	H
5-64	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
5-65	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基	H
5-66	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
5-67	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	H
5-68	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	4-Me
5-69	H	H	Me	3-噻吩基	H
5-70	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-S(O)Me
5-71	H	H	Me	4-Br-Ph	4-Me
5-72	H	H	Me	1,3-苯并二氧杂环戊烯-5-基	4-Me
5-73	H	H	Me	4-I-Ph	4-Me
5-74	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	4-Me
5-75	H	H	Me	4-PhO-Ph	4-Me
5-76	H	H	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
5-77	H	H	Me	Ph	4-S(O)Me
5-78	H	H	H	Ph	H
5-79	H	H	H	Ph	4-Me
5-80	H	H	Et	Ph	H
5-81	H	H	n-Pr	Ph	H
5-82	H	H	CH ₂ Cl	Ph	H
5-83	H	H	CHCl ₂	Ph	H
5-84	H	H	CH ₂ F	Ph	H

[0918]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
5-85	H	H	CHF ₂	Ph	H
5-86	H	H	Cl	Ph	H
5-87	H	H	Et	Ph	4-Me
5-88	H	H	n-Pr	Ph	4-Me
5-89	H	H	CH ₂ Cl	Ph	4-Me
5-90	H	H	CHCl ₂	Ph	4-Me
5-91	H	H	CH ₂ F	Ph	4-Me
5-92	H	H	CHF ₂	Ph	4-Me
5-93	H	H	Cl	Ph	4-Me
5-94	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
5-95	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
5-96	H	H	CH ₂ Cl	4-Cl-Ph	H
5-97	H	H	CHCl ₂	4-Cl-Ph	H
5-98	H	H	CH ₂ F	4-Cl-Ph	H
5-99	H	H	CHF ₂	4-Cl-Ph	H
5-100	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
5-101	H	H	Et	4-Me-Ph	H
5-102	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H
5-103	H	H	CH ₂ Cl	4-Me-Ph	H
5-104	H	H	CHCl ₂	4-Me-Ph	H
5-105	H	H	CH ₂ F	4-Me-Ph	H
5-106	H	H	CHF ₂	4-Me-Ph	H
5-107	H	H	Cl	4-Me-Ph	H
5-108	H	H	Et	2-吡啶基	H
5-109	H	H	n-Pr	2-吡啶基	H
5-110	H	H	CH ₂ Cl	2-吡啶基	H
5-111	H	H	CHCl ₂	2-吡啶基	H
5-112	H	H	CH ₂ F	2-吡啶基	H
5-113	H	H	CHF ₂	2-吡啶基	H
5-114	H	H	Cl	2-吡啶基	H
5-115	H	H	Me	2-吡啶基	H
5-116	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
5-117	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Cl
5-118	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Me
5-119	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
5-120	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Cl
5-121	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Me
5-122	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
5-123	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H

[0919]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
5-124	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	4-Me
5-125	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	H
5-126	H	H	Me	4-(CH ₂ COOH)-Ph	4-Me
5-127	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	4-Me
5-128	H	H	Me	4-Br-Ph	4-Me
5-129	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	H
5-130	H	H	Me	3-Me-Ph	H
5-131	H	H	Me	4-F-Ph	H
5-132	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
5-133	H	H	Me	4-tBu-Ph	H

5-134	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
5-135	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	4-Me
5-136	H	H	Me	3-吡啶基	H
5-137	H	H	Me	4-吡啶基	H
5-138	H	H	C(O)OMe	Ph	H
5-139	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
5-140	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SO ₂ Me
5-141	H	H	Me	3-吡啶基	4-Me
5-142	H	H	Me	2,3-Cl ₂ -Ph	4-Me
5-143	H	H	Me	2-吡啶基	4-Me
5-144	H	H	H	4-Cl-Ph	4-Me
5-145	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
5-146	H	H	Me	Ph	4-Me
5-147	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
5-148	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Me
5-149	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Cl
5-150	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-F
5-151	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H
5-152	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H
5-153	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
5-154	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
5-155	H	H	Me	5-CF ₃ -吡啶-2-基	H
5-156	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
5-157	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
5-158	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
5-159	H	H	CN	4-Cl-Ph	4-Me
5-160	H	H	CN	4-Me-Ph	H
5-161	H	H	CN	4-Me-Ph	4-Me
5-162	H	H	CN	Ph	H

[0920]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
5-163	H	H	CN	Ph	4-Me
5-164	H	H	CN	2-吡啶基	H
5-165	H	H	CN	3-吡啶基	H
5-166	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H
5-167	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H
5-168	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
5-169	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H
5-170	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
5-171	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
5-172	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
5-173	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
5-174	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
5-175	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
5-176	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	H
5-177	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	4-Me
5-178	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	H
5-179	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	4-Me
5-180	H	H	甲酰基	Ph	H
5-181	H	H	甲酰基	Ph	4-Me
5-182	H	H	甲酰基	2-吡啶基	H
5-183	H	H	甲酰基	3-吡啶基	H

5-184	H	H	甲酰基	5-Cl-吡啶-2-基	H
5-185	H	H	甲酰基	5-Br-吡啶-2-基	H
5-186	H	H	甲酰基	5-F-吡啶-2-基	H
5-187	H	H	甲酰基	5-Me-吡啶-2-基	H
5-188	H	H	甲酰基	6-Me-吡啶-3-基	H
5-189	H	H	甲酰基	4-Me-吡啶-2-基	H
5-190	H	H	甲酰基	4-F-吡啶-2-基	H
5-191	H	H	甲酰基	4-Cl-吡啶-2-基	H
5-192	H	H	甲酰基	4-Br-吡啶-2-基	H
5-193	H	H	甲酰基	4-OMe-吡啶-2-基	H
5-194	H	H	CH ₂ OH	5-Me-吡啶-2-基	H
5-195	H	H	CH ₂ OH	4-Cl-Ph	H
5-196	H	H	CH ₂ OH	4-Me-吡啶-2-基	H
5-197	H	H	CH ₂ OH	4-Me-Ph	H
5-198	H	H	CH ₂ OH	Ph	H
5-199	H	H	CH ₂ OH	2-吡啶基	H
5-200	H	H	Me	2-噻唑基	H
5-201	H	H	Me	2-噻唑基	4-Cl

[0921]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
5-202	H	H	Me	2-噻唑基	4-Me
5-203	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
5-204	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Cl
5-205	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Me
5-206	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
5-207	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
5-208	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	4-Me
5-209	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
5-210	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	H
5-211	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	4-Me
5-212	H	H	Me	2-吡啶基	4-F
5-213	H	H	Me	2-吡嗪基	H
5-214	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
5-215	H	H	Me	2-吡嗪基	4-Me
5-216	H	H	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H
5-217	H	H	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	4-Me
5-218	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
5-219	H	H	Me	1,5-Me ₂ -吡啶-3-基	H
5-220	H	H	Me	1,5-Me ₂ -吡啶-3-基	4-Me
5-221	H	H	Me	4,5-Me ₂ -噻唑-2-基	H
5-222	H	H	Me	4,5-Cl ₂ -噻唑-2-基	H
5-223	H	H	Me	2-嘧啶基	H
5-224	H	H	Me	2-嘧啶基	4-Me
5-225	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
5-226	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
5-227	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
5-228	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
5-229	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	4-Me
5-230	H	H	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基	H
5-231	H	H	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基	4-Me
5-232	H	H	Me	3-哒嗪基	H
5-233	H	H	Me	6-Me-哒嗪-3-基	H

5-234	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基	H
5-235	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H
5-236	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Me-6-Cl
5-237	H	H	Me	4-Cl-Ph	6-Cl
5-238	H	H	Me	2-吡啶基	6-Cl
5-239	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	H
5-240	H	H	Me	异喹啉-3-基	H

[0922]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
5-241	H	H	Me	奎啉-2-基	H

[0923] 此外,还生成了本发明的通式(I)化合物的NMR数据。示例性化合物的NMR各自以在400MHz(CDCl₃)下的¹H-NMR谱(¹H核磁共振数据)记录。一些示例性化合物的特征化学位移δ(ppm)如下所列:

[0924] NMR化合物5-236(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0925] 2.37(s,3H);2.43(s,3H);3.35(s,2H);3.69(s,3H);7.22(d,2H);7.35(d,2H);7.90(s,1H)。

[0926] NMR化合物5-237(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0927] 2.35(s,3H);3.36(s,2H);3.69(s,3H);7.24(d,2H);7.37(d,2H);7.52(d,1H);8.01(d,1H)。

[0928] NMR化合物5-238(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0929] 2.37(s,3H);3.49(s,2H);3.68(s,3H);7.30(m,1H);7.54(m,1H);7.56(d,1H);7.80(m,1H);8.05(d,1H);8.55(m,1H)。

[0930] NMR化合物5-2(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

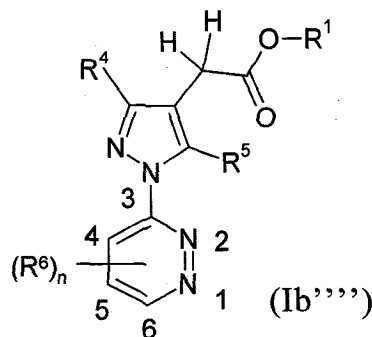
[0931] 2.38(s,3H);3.41(s,2H);3.69(s,3H);7.28(m,2H);7.39(m,3H);7.55(dd,1H);7.88(dd,1H);9.02(dd,1H)。

[0932] NMR化合物5-28(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0933] 2.37(s,3H);3.38(s,2H);3.69(s,3H);7.23(d,2H);7.38(d,2H);7.57(dd,1H);7.98(dd,1H);9.01(dd,1H)。

[0934] 表6:式(Ib''')的化合物

[0935]



[0936]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
6-1	Et	Me	Ph	H
6-2	Et	Me	Ph	4-Me
6-3	Et	Me	3-Cl-Ph	H

6-4	Et	Me	4-Cl-Ph	H
6-5	Et	Me	4-Cl-Ph	4-Me
6-6	Et	Me	2- 噻吩基	H
6-7	Et	Me	3- 噻吩基	H
6-8	Et	Me	3-Me-2- 噻吩基	H
6-9	Et	Me	4-Me-2- 噻吩基	H
6-10	Et	Me	5-Br-2- 噻吩基	H
6-11	Et	Me	5-Br-2- 噻吩基	4-Me
6-12	Et	Me	5-Cl-2- 噻吩基	H
6-13	Et	Me	5-Cl-2- 噻吩基	4-Me
6-14	Et	Me	5-I-2- 噻吩基	H
6-15	Et	Me	5-Me-2- 噻吩基	H
6-16	Et	Me	3- 吡啶基	H
6-17	Et	Me	6-MeO- 吡啶 -3- 基	H
6-18	Et	Me	6-OH- 吡啶 -3- 基	H
6-19	Et	Me	6-Me- 吡啶 -3- 基	H
6-20	Et	Me	4-Me-Ph	H
6-21	Et	Me	4-Me-Ph	4-Me
6-22	Et	Me	4-Br-Ph	H
6-23	Et	Me	4-F-Ph	H
6-24	Et	Me	4-F-Ph	4-Me
6-25	Et	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
6-26	Et	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
6-27	Et	Me	5-F- 吡啶 -2- 基	H
6-28	Et	Me	5-F- 吡啶 -2- 基	4-Me
6-29	Et	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	4-Me
6-30	Et	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	4-Me
6-31	Et	Me	5-Me- 吡啶 -2- 基	H

[0937]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
6-32	Et	Me	5-Me- 吡啶 -2- 基	4-Me
6-33	Et	Me	2- 吡啶基	4-Me
6-34	Et	Me	2- 吡啶基	H
6-35	Et	Me	4- 吡啶基	H
6-36	Et	Me	4-Me- 吡啶 -2- 基	H
6-37	Et	Me	4-Me- 吡啶 -2- 基	4-Me
6-38	Et	Me	2- 噻唑基	H
6-39	Et	Me	4-Me- 噻唑 -2- 基	H
6-40	Et	Me	5-Br- 噻唑 -2- 基	H
6-41	Et	Me	5-Cl- 噻唑 -2- 基	H
6-42	Et	Me	5-Me- 噻唑 -2- 基	H
6-43	Et	Me	4,5-Me ₂ - 噻唑 -2- 基	H
6-44	Et	Me	4,5-Cl ₂ - 噻唑 -2- 基	H
6-45	Et	Me	4,6-Me ₂ - 吡啶 -2- 基	H
6-46	Et	Me	2- 吡嗪基	H
6-47	Et	Me	2- 嘧啶基	H
6-48	Et	Me	2- 嘧啶基	4-Me
6-49	Et	Me	5-Cl- 嘧啶 -2- 基	H
6-50	Et	Me	5-Br- 嘧啶 -2- 基	H
6-51	Et	Me	5-Me- 嘧啶 -2- 基	H
6-52	Et	Me	5-Me- 嘧啶 -2- 基	4-Me
6-53	Et	Me	4,6-Me ₂ - 嘧啶 -2- 基	H

6-54	Et	Me	4,6-Me ₂ -噻啉-2-基	4-Me
6-55	Et	Me	1,3-苯并噻啉-2-基	H
6-56	Et	Me	7-Cl-1,3-苯并噻啉-2-基	H
6-57	Et	Me	1,5-Me ₂ -吡啶-3-基	H
6-58	Et	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-59	Et	Me	5-F-噻啉-2-基	H
6-60	Et	Me	4,6-Me ₂ -噻啉-2-基	H
6-61	Et	Me	3-哒嗪基	H
6-62	Et	Me	6-Me-哒嗪-3-基	H
6-63	Et	Me	1,2,4)-三嗪-3-基	H
6-64	Et	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H
6-65	Pr	Me	Ph	H
6-66	Pr	Me	4-Cl-Ph	H
6-67	Pr	Me	2-噻吩基	H
6-68	Pr	Me	3-吡啶基	H
6-69	Pr	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-70	Pr	Me	4-Me-Ph	H

[0938]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
6-71	Pr	Me	4-Br-Ph	H
6-72	Pr	Me	4-F-Ph	H
6-73	Pr	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-74	Pr	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-75	Pr	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-76	Pr	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-77	Pr	Me	2-吡啶基	H
6-78	Pr	Me	4-吡啶基	H
6-79	i-Pr	Me	Ph	H
6-80	i-Pr	Me	4-Cl-Ph	H
6-81	i-Pr	Me	2-噻吩基	H
6-82	i-Pr	Me	3-吡啶基	H
6-83	i-Pr	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-84	i-Pr	Me	4-Me-Ph	H
6-85	i-Pr	Me	4-Br-Ph	H
6-86	i-Pr	Me	4-F-Ph	H
6-87	i-Pr	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-88	i-Pr	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-89	i-Pr	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-90	i-Pr	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-91	i-Pr	Me	2-吡啶基	H
6-92	i-Pr	Me	4-吡啶基	H
6-93	CH ₂ Ph	Me	Ph	H
6-94	CH ₂ Ph	Me	4-Cl-Ph	H
6-95	CH ₂ Ph	Me	2-噻吩基	H
6-96	CH ₂ Ph	Me	2-吡啶基	H
6-97	丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
6-98	丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-99	丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-100	丙-2-炔-1-基	Me	3-噻吩基	H
6-101	丙-2-炔-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
6-102	丙-2-炔-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
6-103	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H

6-104	丙-2-炔-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
6-105	丙-2-炔-1-基	Me	3-吡啶基	H
6-106	丙-2-炔-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
6-107	丙-2-炔-1-基	H	Ph	H
6-108	丙-2-炔-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-109	丙-2-炔-1-基	Me	4-Me-Ph	H

[0939]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
6-110	丙-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
6-111	丙-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
6-112	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-113	丙-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-114	丙-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-115	丙-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-116	丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-117	丙-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
6-118	丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
6-119	丙-2-炔-1-基	Me	Ph	4-Me
6-120	环丙基甲基	Me	Ph	H
6-121	环丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-122	环丙基甲基	Me	2-噻吩基	H
6-123	环丙基甲基	Me	3-噻吩基	H
6-124	环丙基甲基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
6-125	环丙基甲基	Me	3-吡啶基	H
6-126	环丙基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
6-127	环丙基甲基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
6-128	环丙基甲基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
6-129	环丙基甲基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
6-130	环丙基甲基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
6-131	环丙基甲基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-132	环丙基甲基	Me	4-Me-Ph	H
6-133	环丙基甲基	Me	4-Br-Ph	H
6-134	环丙基甲基	Me	4-F-Ph	H
6-135	环丙基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-136	环丙基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-137	环丙基甲基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-138	环丙基甲基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-139	环丙基甲基	Me	2-吡啶基	H
6-140	环丙基甲基	Me	4-吡啶基	H
6-141	环丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
6-142	环丙基甲基	Me	Ph	4-Me
6-143	环丙基甲基	H	Ph	H
6-144	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
6-145	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-146	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-147	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-148	(1-甲基环丙基)甲基	Me	Ph	H

[0940]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
6-149	(1-甲基环丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-150	(1-甲基环丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H

6-151	(1-甲基环丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H
6-152	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
6-153	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-154	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-155	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-156	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	Ph	H
6-157	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-158	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H
6-159	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H
6-160	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
6-161	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-162	丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-163	丁-2-炔-1-基	Me	3-噻吩基	H
6-164	丁-2-炔-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
6-165	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
6-166	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
6-167	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
6-168	丁-2-炔-1-基	Me	3-吡啶基	H
6-169	丁-2-炔-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
6-170	丁-2-炔-1-基	H	Ph	H
6-171	丁-2-炔-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-172	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-Ph	H
6-173	丁-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
6-174	丁-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
6-175	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-176	丁-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-177	丁-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-178	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-179	丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-180	丁-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
6-181	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
6-182	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	4-Me
6-183	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
6-184	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-185	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-186	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-187	1-环丙基乙基	Me	Ph	H

[0941]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
6-188	1-环丙基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
6-189	1-环丙基乙基	Me	2-噻吩基	H
6-190	1-环丙基乙基	Me	2-吡啶基	H
6-191	烯丙基	Me	Ph	H
6-192	烯丙基	Me	4-Cl-Ph	H
6-193	烯丙基	Me	2-噻吩基	H
6-194	烯丙基	Me	2-吡啶基	H
6-195	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H
6-196	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-197	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-198	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-199	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
6-200	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H

6-201	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-202	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-203	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H
6-204	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-205	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-206	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-207	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
6-208	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-209	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-210	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-211	环丁基甲基	Me	Ph	H
6-212	环丁基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-213	环丁基甲基	Me	2-噻吩基	H
6-214	环丁基甲基	Me	2-吡啶基	H
6-215	环戊基甲基	Me	Ph	H
6-216	环戊基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-217	环戊基甲基	Me	2-噻吩基	H
6-218	环戊基甲基	Me	2-吡啶基	H
6-219	环己基甲基	Me	Ph	H
6-220	环己基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-221	环己基甲基	Me	2-噻吩基	H
6-222	环己基甲基	Me	2-吡啶基	H
6-223	丁-3-烯-1-基	Me	Ph	H
6-224	丁-3-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-225	丁-3-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-226	丁-3-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H

[0942]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
6-227	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
6-228	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-229	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-230	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	3-噻吩基	H
6-231	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
6-232	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
6-233	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
6-234	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
6-235	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	3-吡啶基	H
6-236	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
6-237	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
6-238	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-239	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-Ph	H
6-240	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Br-Ph	H
6-241	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-F-Ph	H
6-242	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-243	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-244	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-245	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-246	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-247	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-吡啶基	H
6-248	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
6-249	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	Ph	4-Me
6-250	2-氯代丙-2-烯-1-基	H	Ph	H

6-251	2- 甲氧基乙基	Me	Ph	H
6-252	2- 甲氧基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
6-253	2- 甲氧基乙基	Me	2- 噻吩基	H
6-254	2- 甲氧基乙基	Me	2- 吡啶基	H
6-255	四氢呋喃-2- 基甲基	Me	Ph	H
6-256	四氢呋喃-2- 基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-257	四氢呋喃-2- 基甲基	Me	2- 噻吩基	H
6-258	四氢呋喃-2- 基甲基	Me	2- 吡啶基	H
6-259	2-(二甲基氨基) 乙基	Me	Ph	H
6-260	2-(二甲基氨基) 乙基	Me	4-Cl-Ph	H
6-261	2-(二甲基氨基) 乙基	Me	2- 噻吩基	H
6-262	2-(二甲基氨基) 乙基	Me	2- 吡啶基	H
6-263	氧杂环丁-3- 基	Me	Ph	H
6-264	氧杂环丁-3- 基	Me	4-Cl-Ph	H
6-265	氧杂环丁-3- 基	Me	2- 噻吩基	H

[0943]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
6-266	氧杂环丁-3- 基	Me	2- 吡啶基	H
6-267	(3- 甲基氧杂环丁-3- 基) 甲基	Me	Ph	H
6-268	(3- 甲基氧杂环丁-3- 基) 甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-269	(3- 甲基氧杂环丁-3- 基) 甲基	Me	2- 噻吩基	H
6-270	(3- 甲基氧杂环丁-3- 基) 甲基	Me	2- 吡啶基	H
6-271	2,2,2- 三氟乙基	Me	Ph	H
6-272	2,2,2- 三氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
6-273	2,2,2- 三氟乙基	Me	2- 噻吩基	H
6-274	2,2,2- 三氟乙基	Me	3- 吡啶基	H
6-275	2,2,2- 三氟乙基	Me	6-Me- 吡啶-3- 基	H
6-276	2,2,2- 三氟乙基	Me	4-Me-Ph	H
6-277	2,2,2- 三氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
6-278	2,2,2- 三氟乙基	Me	4-F-Ph	H
6-279	2,2,2- 三氟乙基	Me	5-Cl- 吡啶-2- 基	H
6-280	2,2,2- 三氟乙基	Me	5-Br- 吡啶-2- 基	H
6-281	2,2,2- 三氟乙基	Me	5-F- 吡啶-2- 基	H
6-282	2,2,2- 三氟乙基	Me	5-Me- 吡啶-2- 基	H
6-283	2,2,2- 三氟乙基	Me	2- 吡啶基	H
6-284	2,2,2- 三氟乙基	Me	4- 吡啶基	H
6-285	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	Ph	H
6-286	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
6-287	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	2- 噻吩基	H
6-288	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	3- 吡啶基	H
6-289	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	6-Me- 吡啶-3- 基	H
6-290	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
6-291	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
6-292	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-F-Ph	H
6-293	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-Cl- 吡啶-2- 基	H
6-294	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-Br- 吡啶-2- 基	H
6-295	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-F- 吡啶-2- 基	H
6-296	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-Me- 吡啶-2- 基	H
6-297	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	2- 吡啶基	H
6-298	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4- 吡啶基	H
6-299	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	Ph	H
6-300	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H

6-301	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	2-噻吩基	H
6-302	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	3-吡啶基	H
6-303	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-304	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-Me-Ph	H

[0944]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
6-305	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
6-306	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-F-Ph	H
6-307	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-308	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-309	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-310	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-311	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	2-吡啶基	H
6-312	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-吡啶基	H
6-313	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	Ph	H
6-314	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
6-315	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	2-噻吩基	H
6-316	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	3-吡啶基	H
6-317	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-318	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
6-319	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
6-320	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-F-Ph	H
6-321	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-322	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-323	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-324	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-325	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	2-吡啶基	H
6-326	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-吡啶基	H
6-327	2,2-二氟乙基	Me	Ph	H
6-328	2,2-二氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
6-329	2,2-二氟乙基	Me	2-噻吩基	H
6-330	2,2-二氟乙基	Me	2-吡啶基	H
6-331	Ph	Me	Ph	H
6-332	Ph	Me	4-Cl-Ph	H
6-333	Ph	Me	2-噻吩基	H
6-334	Ph	Me	2-吡啶基	H
6-335	2-氟乙基	Me	Ph	H
6-336	2-氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
6-337	2-氟乙基	Me	2-噻吩基	H
6-338	2-氟乙基	Me	2-吡啶基	H
6-339	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	Ph	H
6-340	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
6-341	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-噻吩基	H
6-342	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-吡啶基	H
6-343	1-乙基-5-甲基-1H-吡唑-4-甲基	Me	Ph	H

[0945]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
6-344	1-乙基-5-甲基-1H-吡唑-4-甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-345	1-乙基-5-甲基-1H-吡唑-4-甲基	Me	2-噻吩基	H
6-346	1-乙基-5-甲基-1H-吡唑-4-甲基	Me	2-吡啶基	H
6-347	Et	Me	2-吡啶基	6-Cl

6-348	丁-3-炔-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-349	丁-3-炔-2-基	Me	异喹啉-3-基	H
6-350	丁-3-炔-2-基	Me	喹啉-2-基	H
6-351	丁-3-炔-2-基	Me	Ph	H
6-352	丁-3-炔-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-353	丁-3-炔-2-基	Me	2-噻吩基	H
6-354	丁-3-炔-2-基	Me	3-吡啶基	H
6-355	丁-3-炔-2-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-356	丁-3-炔-2-基	Me	4-Me-Ph	H
6-357	丁-3-炔-2-基	Me	4-Br-Ph	H
6-358	丁-3-炔-2-基	Me	4-F-Ph	H
6-359	丁-3-炔-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-360	丁-3-炔-2-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-361	丁-3-炔-2-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-362	丁-3-炔-2-基	Me	2-吡啶基	H
6-363	丁-3-炔-2-基	Me	4-吡啶基	H
6-364	Et	Me	异喹啉-3-基	H
6-365	Et	Me	喹啉-2-基	H

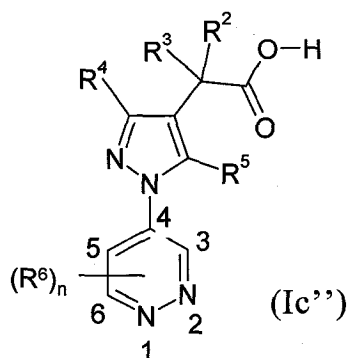
[0946] 此外,还生成了本发明的通式(I)化合物的NMR数据。示例性化合物的NMR各自以在400MHz(CDCl₃)下的¹H-NMR谱(¹H核磁共振数据)记录。一些示例性化合物的特征化学位移δ(ppm)如下所列:

[0947] NMR化合物6-347(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[0948] 1.23(t,3H);2.38(s,3H);3.48(s,2H);4.12(q,2H);7.41(m,1H);7.57(d,1H);7.68(m,1H);7.93(m,1H);8.09(d,1H);8.62(m,1H)。

[0949] 表7:式(IC'')的化合物

[0950]



[0951]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
7-1	H	H	Ph	Ph	H
7-2	H	H	Me	Ph	H
7-3	H	H	Me	5-I-2-噻吩基	H
7-4	H	H	Me	2-呋喃基	H
7-5	Me	H	Me	Ph	5-Me
7-6	H	H	Me	Ph	5-CF ₃
7-7	H	H	Me	Ph	5-Me

7-8	H	H	Me	4-MeO-Ph	5-Me
7-9	H	H	Me	4-MeO-Ph	H
7-10	Me	H	Me	Ph	H
7-11	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me
7-12	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Cl
7-13	H	H	Me	4-Me-Ph	H
7-14	H	H	Me	3-Cl-Ph	H
7-15	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	H
7-16	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	5-Me
7-17	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	5-Me
7-18	H	H	Me	3-Cl-Ph	5-Me
7-19	H	H	Me	2-Cl-Ph	5-Me
7-20	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	5-Me
7-21	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	5-Me
7-22	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Me
7-23	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
7-24	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	H
7-25	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	H
7-26	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Cl
7-27	H	H	Me	Ph	5-Cl
7-28	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
7-29	H	H	Me	4-tBu-Ph	5-Me
7-30	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph	5-Me

[0952]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
7-31	H	H	Me	Ph	5-OMe
7-32	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-OMe
7-33	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me
7-34	H	H	Me	4-F-Ph	5-Cl
7-35	H	H	Me	4-F-Ph	5-Me
7-36	H	H	Me	3-Me-Ph	5-Me
7-37	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	5-Me
7-38	H	H	Me	3-Br-Ph	5-Me
7-39	H	H	Me	4-Ph-Ph	5-Me
7-40	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	H
7-41	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph	H
7-42	H	H	Me	Ph	5-SMe
7-43	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SMe
7-44	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H
7-45	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	H
7-46	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	5-Me
7-47	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	5-Me
7-48	H	H	Me	2-吡啶基	5-Cl
7-49	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-F
7-50	H	H	Me	2-噻吩基	5-Me
7-51	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	5-Me
7-52	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	5-Me
7-53	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Me
7-54	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Cl
7-55	H	H	Me	3-噻吩基	5-Me
7-56	H	H	Me	2-噻吩基	H
7-57	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	H

7-58	H	H	Me	4-Me-2- 噻吩基	H
7-59	H	H	Me	5-Cl-2- 噻吩基	H
7-60	H	H	Me	5-Me-2- 噻吩基	H
7-61	H	H	Me	6-MeO- 吡啶 -3- 基	H
7-62	H	H	Me	5-Br-2- 噻吩基	H
7-63	H	H	Me	5-Br-2- 噻吩基	5-Me
7-64	H	H	Me	3- 噻吩基	H
7-65	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-S(O)Me
7-66	H	H	Me	4-Br-Ph	5-Me
7-67	H	H	Me	1,3- 苯并二氧杂环戊烯 -5- 基	5-Me
7-68	H	H	Me	4-I-Ph	5-Me

[0953]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
7-69	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	5-Me
7-70	H	H	Me	4-PhO-Ph	5-Me
7-71	H	H	Me	6-OH- 吡啶 -3- 基	H
7-72	H	H	Me	Ph	5-S(O)Me
7-73	H	H	H	Ph	H
7-74	H	H	H	Ph	5-Me
7-75	H	H	Et	Ph	H
7-76	H	H	n-Pr	Ph	H
7-77	H	H	CH ₂ Cl	Ph	H
7-78	H	H	CHCl ₂	Ph	H
7-79	H	H	CH ₂ F	Ph	H
7-80	H	H	CHF ₂	Ph	H
7-81	H	H	Cl	Ph	H
7-82	H	H	Et	Ph	5-Me
7-83	H	H	n-Pr	Ph	5-Me
7-84	H	H	CH ₂ Cl	Ph	5-Me
7-85	H	H	CHCl ₂	Ph	5-Me
7-86	H	H	CH ₂ F	Ph	5-Me
7-87	H	H	CHF ₂	Ph	5-Me
7-88	H	H	Cl	Ph	5-Me
7-89	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
7-90	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
7-91	H	H	CH ₂ Cl	4-Cl-Ph	H
7-92	H	H	CHCl ₂	4-Cl-Ph	H
7-93	H	H	CH ₂ F	4-Cl-Ph	H
7-94	H	H	CHF ₂	4-Cl-Ph	H
7-95	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
7-96	H	H	Et	4-Me-Ph	H
7-97	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H
7-98	H	H	CH ₂ Cl	4-Me-Ph	H
7-99	H	H	CHCl ₂	4-Me-Ph	H
7-100	H	H	CH ₂ F	4-Me-Ph	H
7-101	H	H	CHF ₂	4-Me-Ph	H
7-102	H	H	Cl	4-Me-Ph	H
7-103	H	H	Et	2- 吡啶基	H
7-104	H	H	n-Pr	2- 吡啶基	H
7-105	H	H	CH ₂ Cl	2- 吡啶基	H
7-106	H	H	CHCl ₂	2- 吡啶基	H
7-107	H	H	CH ₂ F	2- 吡啶基	H

[0954]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
7-108	H	H	CHF ₂	2-吡啶基	H
7-109	H	H	Cl	2-吡啶基	H
7-110	H	H	Me	2-吡啶基	H
7-111	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
7-112	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Cl
7-113	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Me
7-114	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
7-115	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Cl
7-116	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Me
7-117	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
7-118	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
7-119	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	5-Me
7-120	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	H
7-121	H	H	Me	4-CH ₂ COOH-Ph	5-Me
7-122	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	5-Me
7-123	H	H	Me	4-Br-Ph	H
7-124	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	H
7-125	H	H	Me	3-Me-Ph	H
7-126	H	H	Me	4-F-Ph	H
7-127	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
7-128	H	H	Me	4-tBu-Ph	H
7-129	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
7-130	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	5-Me
7-131	H	H	Me	3-吡啶基	H
7-132	H	H	Me	4-吡啶基	H
7-133	H	H	C(O)OMe	Ph	H
7-134	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
7-135	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SO ₂ Me
7-136	H	H	Me	3-吡啶基	5-Me
7-137	H	H	Me	2,3-Cl ₂ -Ph	5-Me
7-138	H	H	Me	2-吡啶基	5-Me
7-139	H	H	H	4-Cl-Ph	5-Me
7-140	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
7-141	H	H	Me	Ph	5-Me
7-142	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
7-143	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Me
7-144	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Cl
7-145	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-F
7-146	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H

[0955]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
7-147	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H
7-148	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
7-149	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
7-150	H	H	Me	5-CF ₃ -吡啶-2-基	H
7-151	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
7-152	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
7-153	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
7-154	H	H	CN	4-Cl-Ph	5-Me
7-155	H	H	CN	4-Me-Ph	H

7-156	H	H	CN	4-Me-Ph	5-Me
7-157	H	H	CN	Ph	H
7-158	H	H	CN	Ph	5-Me
7-159	H	H	CN	2-吡啶基	H
7-160	H	H	CN	3-吡啶基	H
7-161	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H
7-162	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H
7-163	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
7-164	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H
7-165	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
7-166	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
7-167	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
7-168	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
7-169	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
7-170	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
7-171	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	H
7-172	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	5-Me
7-173	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	H
7-174	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	5-Me
7-175	H	H	甲酰基	Ph	H
7-176	H	H	甲酰基	Ph	5-Me
7-177	H	H	甲酰基	2-吡啶基	H
7-178	H	H	甲酰基	3-吡啶基	H
7-179	H	H	甲酰基	5-Cl-吡啶-2-基	H
7-180	H	H	甲酰基	5-Br-吡啶-2-基	H
7-181	H	H	甲酰基	5-F-吡啶-2-基	H
7-182	H	H	甲酰基	5-Me-吡啶-2-基	H
7-183	H	H	甲酰基	6-Me-吡啶-3-基	H
7-184	H	H	甲酰基	4-Me-吡啶-2-基	H
7-185	H	H	甲酰基	4-F-吡啶-2-基	H

[0956]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
7-186	H	H	甲酰基	4-Cl-吡啶-2-基	H
7-187	H	H	甲酰基	4-Br-吡啶-2-基	H
7-188	H	H	甲酰基	4-OMe-吡啶-2-基	H
7-189	H	H	CH ₂ OH	5-Me-吡啶-2-基	H
7-190	H	H	CH ₂ OH	4-Cl-Ph	H
7-191	H	H	CH ₂ OH	4-Me-吡啶-2-基	H
7-192	H	H	CH ₂ OH	4-Me-Ph	H
7-193	H	H	CH ₂ OH	Ph	H
7-194	H	H	CH ₂ OH	2-吡啶基	H
7-195	H	H	Me	2-噻唑基	H
7-196	H	H	Me	2-噻唑基	5-Cl
7-197	H	H	Me	2-噻唑基	5-Me
7-198	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
7-199	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Cl
7-200	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Me
7-201	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
7-202	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
7-203	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	5-Me
7-204	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
7-205	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	H

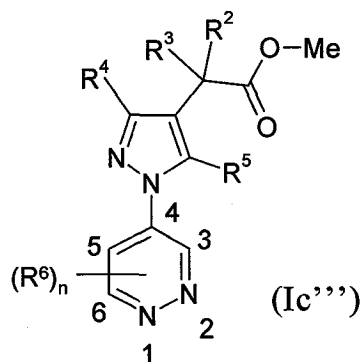
7-206	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	5-Me
7-207	H	H	Me	2-吡啶基	5-F
7-208	H	H	Me	2-吡嗪基	H
7-209	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
7-210	H	H	Me	2-吡嗪基	5-Me
7-211	H	H	Me	1,3-苯并噁唑-2-基	H
7-212	H	H	Me	1,3-苯并噁唑-2-基	5-Me
7-213	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
7-214	H	H	Me	1,5-Me ₂ -吡唑-3-基	H
7-215	H	H	Me	1,5-Me ₂ -吡唑-3-基	5-Me
7-216	H	H	Me	4,5-Me ₂ -噁唑-2-基	H
7-217	H	H	Me	4,5-Cl ₂ -噁唑-2-基	H
7-218	H	H	Me	2-嘧啶基	H
7-219	H	H	Me	2-嘧啶基	5-Me
7-220	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
7-221	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
7-222	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
7-223	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
7-224	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	5-Me

[0957]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
7-225	H	H	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基	H
7-226	H	H	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基	5-Me
7-227	H	H	Me	3-哒嗪基	H
7-228	H	H	Me	6-Me-哒嗪-3-基	H
7-229	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基	H
7-230	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H
7-231	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	H
7-232	H	H	Me	异喹啉-3-基	H
7-233	H	H	Me	喹啉-2-基	H

[0958] 表8:式(IC'")的化合物

[0959]



[0960]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
8-1	H	H	Ph	Ph	H
8-2	H	H	Me	Ph	H
8-3	H	H	Me	5-I-2-噁吩基	H
8-4	H	H	Me	2-呋喃基	H
8-5	Me	H	Me	Ph	5-Me
8-6	H	H	Me	Ph	5-CF ₃

8-7	H	H	Me	Ph	5-Me
8-8	H	H	Me	4-MeO-Ph	5-Me
8-9	H	H	Me	4-MeO-Ph	H
8-10	Me	H	Me	Ph	H
8-11	H	H	Me	4-Me-Ph	H
8-12	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me
8-13	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Cl
8-14	H	H	Me	3-Cl-Ph	H
8-15	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	H
8-16	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	5-Me

[0961]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
8-17	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	5-Me
8-18	H	H	Me	3-Cl-Ph	5-Me
8-19	H	H	Me	2-Cl-Ph	5-Me
8-20	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	5-Me
8-21	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	5-Me
8-22	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Me
8-23	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
8-24	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	H
8-25	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	H
8-26	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Cl
8-27	H	H	Me	Ph	5-Cl
8-28	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
8-29	H	H	Me	4-tBu-Ph	5-Me
8-30	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph	5-Me
8-31	H	H	Me	Ph	5-OMe
8-32	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-OMe
8-33	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me
8-34	H	H	Me	4-F-Ph	5-Me
8-35	H	H	Me	4-F-Ph	5-Cl
8-36	H	H	Me	3-Me-Ph	5-Me
8-37	H	H	Me	4-COOH-Ph	5-Me
8-38	H	H	Me	3-Br-Ph	5-Me
8-39	H	H	Me	4-Ph-Ph	5-Me
8-40	H	H	Me	4-COOH-Ph	H
8-41	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph	H
8-42	H	H	Me	Ph	5-SMe
8-43	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SMe
8-44	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H
8-45	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	H
8-46	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	5-Me
8-47	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	5-Me
8-48	H	H	Me	2-吡啶基	5-Cl
8-49	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-F
8-50	H	H	Me	2-噻吩基	5-Me
8-51	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	5-Me
8-52	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	5-Me
8-53	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Me
8-54	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Cl
8-55	H	H	Me	3-噻吩基	5-Me

[0962]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
8-56	H	H	Me	2- 噻吩基	H
8-57	H	H	Me	3-Me-2- 噻吩基	H
8-58	H	H	Me	4-Me-2- 噻吩基	H
8-59	H	H	Me	5-Cl-2- 噻吩基	H
8-60	H	H	Me	5-Me-2- 噻吩基	H
8-61	H	H	Me	6-MeO- 吡啶 -3- 基	H
8-62	H	H	Me	5-Br-2- 噻吩基	H
8-63	H	H	Me	5-Br-2- 噻吩基	5-Me
8-64	H	H	Me	3- 噻吩基	H
8-65	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-S(O)Me
8-66	H	H	Me	4-Br-Ph	5-Me
8-67	H	H	Me	1,3- 苯并二氧杂环戊烯 -5- 基	5-Me
8-68	H	H	Me	4-I-Ph	5-Me
8-69	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	5-Me
8-70	H	H	Me	4-PhO-Ph	5-Me
8-71	H	H	Me	6-OH- 吡啶 -3- 基	H
8-72	H	H	Me	Ph	5-S(O)Me
8-73	H	H	H	Ph	H
8-74	H	H	H	Ph	5-Me
8-75	H	H	Et	Ph	H
8-76	H	H	n-Pr	Ph	H
8-77	H	H	CH ₂ Cl	Ph	H
8-78	H	H	CHCl ₂	Ph	H
8-79	H	H	CH ₂ F	Ph	H
8-80	H	H	CHF ₂	Ph	H
8-81	H	H	Cl	Ph	H
8-82	H	H	Et	Ph	5-Me
8-83	H	H	n-Pr	Ph	5-Me
8-84	H	H	CH ₂ Cl	Ph	5-Me
8-85	H	H	CHCl ₂	Ph	5-Me
8-86	H	H	CH ₂ F	Ph	5-Me
8-87	H	H	CHF ₂	Ph	5-Me
8-88	H	H	Cl	Ph	5-Me
8-89	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
8-90	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
8-91	H	H	CH ₂ Cl	4-Cl-Ph	H
8-92	H	H	CHCl ₂	4-Cl-Ph	H
8-93	H	H	CH ₂ F	4-Cl-Ph	H

[0963]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
8-94	H	H	CHF ₂	4-Cl-Ph	H
8-95	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
8-96	H	H	Et	4-Me-Ph	H
8-97	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H
8-98	H	H	CH ₂ Cl	4-Me-Ph	H
8-99	H	H	CHCl ₂	4-Me-Ph	H
8-100	H	H	CH ₂ F	4-Me-Ph	H
8-101	H	H	CHF ₂	4-Me-Ph	H
8-102	H	H	Cl	4-Me-Ph	H
8-103	H	H	Et	2- 吡啶基	H
8-104	H	H	n-Pr	2- 吡啶基	H

8-105	H	H	CH ₂ Cl	2-吡啶基	H
8-106	H	H	CHCl ₂	2-吡啶基	H
8-107	H	H	CH ₂ F	2-吡啶基	H
8-108	H	H	CHF ₂	2-吡啶基	H
8-109	H	H	Cl	2-吡啶基	H
8-110	H	H	Me	2-吡啶基	H
8-111	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
8-112	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Cl
8-113	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Me
8-114	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
8-115	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Cl
8-116	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Me
8-117	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
8-118	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
8-119	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	5-Me
8-120	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	H
8-121	H	H	Me	4-(CH ₂ COOH)-Ph	5-Me
8-122	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	5-Me
8-123	H	H	Me	4-Br-Ph	5-Me
8-124	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	H
8-125	H	H	Me	3-Me-Ph	H
8-126	H	H	Me	4-F-Ph	H
8-127	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
8-128	H	H	Me	4-tBu-Ph	H
8-129	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
8-130	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	5-Me
8-131	H	H	Me	3-吡啶基	H
8-132	H	H	Me	4-吡啶基	H

[0964]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
8-133	H	H	C(O)OMe	Ph	H
8-134	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
8-135	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SO ₂ Me
8-136	H	H	Me	3-吡啶基	5-Me
8-137	H	H	Me	2,3-Cl ₂ -Ph	5-Me
8-138	H	H	Me	2-吡啶基	5-Me
8-139	H	H	H	4-Cl-Ph	5-Me
8-140	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
8-141	H	H	Me	Ph	5-Me
8-142	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
8-143	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Me
8-144	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Cl
8-145	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-F
8-146	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H
8-147	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H
8-148	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
8-149	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
8-150	H	H	Me	5-CF ₃ -吡啶-2-基	H
8-151	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
8-152	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
8-153	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
8-154	H	H	CN	4-Cl-Ph	5-Me

8-155	H	H	CN	4-Me-Ph	H
8-156	H	H	CN	4-Me-Ph	5-Me
8-157	H	H	CN	Ph	H
8-158	H	H	CN	Ph	5-Me
8-159	H	H	CN	2-吡啶基	H
8-160	H	H	CN	3-吡啶基	H
8-161	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H
8-162	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H
8-163	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
8-164	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H
8-165	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
8-166	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
8-167	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
8-168	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
8-169	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
8-170	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
8-171	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	H

[0965]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
8-172	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	5-Me
8-173	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	H
8-174	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	5-Me
8-175	H	H	甲酰基	Ph	H
8-176	H	H	甲酰基	Ph	5-Me
8-177	H	H	甲酰基	2-吡啶基	H
8-178	H	H	甲酰基	3-吡啶基	H
8-179	H	H	甲酰基	5-Cl-吡啶-2-基	H
8-180	H	H	甲酰基	5-Br-吡啶-2-基	H
8-181	H	H	甲酰基	5-F-吡啶-2-基	H
8-182	H	H	甲酰基	5-Me-吡啶-2-基	H
8-183	H	H	甲酰基	6-Me-吡啶-3-基	H
8-184	H	H	甲酰基	4-Me-吡啶-2-基	H
8-185	H	H	甲酰基	4-F-吡啶-2-基	H
8-186	H	H	甲酰基	4-Cl-吡啶-2-基	H
8-187	H	H	甲酰基	4-Br-吡啶-2-基	H
8-188	H	H	甲酰基	4-OMe-吡啶-2-基	H
8-189	H	H	CH ₂ OH	5-Me-吡啶-2-基	H
8-190	H	H	CH ₂ OH	4-Cl-Ph	H
8-191	H	H	CH ₂ OH	4-Me-吡啶-2-基	H
8-192	H	H	CH ₂ OH	4-Me-Ph	H
8-193	H	H	CH ₂ OH	Ph	H
8-194	H	H	CH ₂ OH	2-吡啶基	H
8-195	H	H	Me	2-噻唑基	H
8-196	H	H	Me	2-噻唑基	5-Cl
8-197	H	H	Me	2-噻唑基	5-Me
8-198	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
8-199	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Cl
8-200	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Me
8-201	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
8-202	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
8-203	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	5-Me
8-204	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H

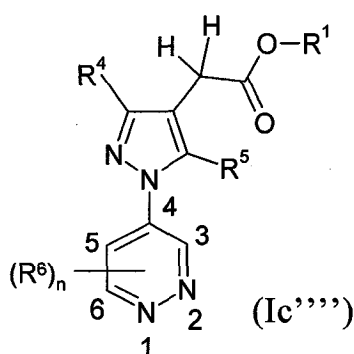
8-205	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	H
8-206	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	5-Me
8-207	H	H	Me	2-吡啶基	5-F
8-208	H	H	Me	2-吡嗪基	H
8-209	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
8-210	H	H	Me	2-吡嗪基	5-Me

[0966]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
8-211	H	H	Me	1,3-苯并噁唑-2-基	H
8-212	H	H	Me	1,3-苯并噁唑-2-基	5-Me
8-213	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基	H
8-214	H	H	Me	1,5-Me ₂ -吡唑-3-基	H
8-215	H	H	Me	1,5-Me ₂ -吡唑-3-基	5-Me
8-216	H	H	Me	4,5-Me ₂ -噁唑-2-基	H
8-217	H	H	Me	4,5-Cl ₂ -噁唑-2-基	H
8-218	H	H	Me	2-嘧啶基	H
8-219	H	H	Me	2-嘧啶基	5-Me
8-220	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
8-221	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
8-222	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
8-223	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
8-224	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	5-Me
8-225	H	H	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基	H
8-226	H	H	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基	5-Me
8-227	H	H	Me	3-哒嗪基	H
8-228	H	H	Me	6-Me-哒嗪-3-基	H
8-229	H	H	Me	3-(1,2,4)-三嗪基	H
8-230	H	H	Me	6-Me-(1,2,4)-三嗪-3-基	H
8-231	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	H
8-232	H	H	Me	异喹啉-3-基	H
8-233	H	H	Me	喹啉-2-基	H

[0967] 表9:式(IC''')的化合物

[0968]



[0969]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
9-1	Et	Me	Ph	H
9-2	Et	Me	Ph	5-Me

[0970]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
9-3	Et	Me	3-Cl-Ph	H
9-4	Et	Me	4-Cl-Ph	H

9-5	Et	Me	4-Cl-Ph	5-Me
9-6	Et	Me	2-噻吩基	H
9-7	Et	Me	3-噻吩基	H
9-8	Et	Me	3-Me-2-噻吩基	H
9-9	Et	Me	4-Me-2-噻吩基	H
9-10	Et	Me	5-Br-2-噻吩基	H
9-11	Et	Me	5-Br-2-噻吩基	5-Me
9-12	Et	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
9-13	Et	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Me
9-14	Et	Me	5-I-2-噻吩基	H
9-15	Et	Me	5-Me-2-噻吩基	H
9-16	Et	Me	3-吡啶基	H
9-17	Et	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
9-18	Et	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
9-19	Et	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-20	Et	Me	4-Me-Ph	H
9-21	Et	Me	4-Me-Ph	5-Me
9-22	Et	Me	4-Br-Ph	H
9-23	Et	Me	4-F-Ph	H
9-24	Et	Me	4-F-Ph	5-Me
9-25	Et	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-26	Et	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-27	Et	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-28	Et	Me	5-F-吡啶-2-基	5-Me
9-29	Et	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Me
9-30	Et	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Me
9-31	Et	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-32	Et	Me	5-Me-吡啶-2-基	5-Me
9-33	Et	Me	2-吡啶基	5-Me
9-34	Et	Me	2-吡啶基	H
9-35	Et	Me	4-吡啶基	H
9-36	Et	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
9-37	Et	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Me
9-38	Et	Me	2-噻唑基	H
9-39	Et	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
9-40	Et	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
9-41	Et	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H

[0971]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
9-42	Et	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
9-43	Et	Me	4,5-Me ₂ -噻唑-2-基	H
9-44	Et	Me	4,5-Cl ₂ -噻唑-2-基	H
9-45	Et	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	H
9-46	Et	Me	2-吡嗪基	H
9-47	Et	Me	2-嘧啶基	H
9-48	Et	Me	2-嘧啶基	5-Me
9-49	Et	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
9-50	Et	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
9-51	Et	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
9-52	Et	Me	5-Me-嘧啶-2-基	5-Me
9-53	Et	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基	H
9-54	Et	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基	5-Me

9-55	Et	Me	1,3- 苯并噻唑 -2- 基	H
9-56	Et	Me	7-Cl-1,3- 苯并噻唑 -2- 基	H
9-57	Et	Me	1,5-Me ₂ - 吡唑 -3- 基	H
9-58	Et	Me	5-Me- 吡嗪 -2- 基	H
9-59	Et	Me	5-F- 嘧啶 -2- 基	H
9-60	Et	Me	4,6-Me ₂ - 嘧啶 -2- 基	H
9-61	Et	Me	3- 哒嗪基	H
9-62	Et	Me	6-Me- 哒嗪 -3- 基	H
9-63	Et	Me	1,2,4- 三嗪 -3- 基	H
9-64	Et	Me	6-Me-1,2,4- 三嗪 -3- 基	H
9-65	Pr	Me	Ph	H
9-66	Pr	Me	4-Cl-Ph	H
9-67	Pr	Me	2- 噻吩基	H
9-68	Pr	Me	3- 吡啶基	H
9-69	Pr	Me	6-Me- 吡啶 -3- 基	H
9-70	Pr	Me	4-Me-Ph	H
9-71	Pr	Me	4-Br-Ph	H
9-72	Pr	Me	4-F-Ph	H
9-73	Pr	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
9-74	Pr	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
9-75	Pr	Me	5-F- 吡啶 -2- 基	H
9-76	Pr	Me	5-Me- 吡啶 -2- 基	H
9-77	Pr	Me	2- 吡啶基	H
9-78	Pr	Me	4- 吡啶基	H
9-79	i-Pr	Me	Ph	H
9-80	i-Pr	Me	4-Cl-Ph	H

[0972]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
9-81	i-Pr	Me	2- 噻吩基	H
9-82	i-Pr	Me	3- 吡啶基	H
9-83	i-Pr	Me	6-Me- 吡啶 -3- 基	H
9-84	i-Pr	Me	4-Me-Ph	H
9-85	i-Pr	Me	4-Br-Ph	H
9-86	i-Pr	Me	4-F-Ph	H
9-87	i-Pr	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
9-88	i-Pr	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
9-89	i-Pr	Me	5-F- 吡啶 -2- 基	H
9-90	i-Pr	Me	5-Me- 吡啶 -2- 基	H
9-91	i-Pr	Me	2- 吡啶基	H
9-92	i-Pr	Me	4- 吡啶基	H
9-93	CH ₂ Ph	Me	Ph	H
9-94	CH ₂ Ph	Me	4-Cl-Ph	H
9-95	CH ₂ Ph	Me	2- 噻吩基	H
9-96	CH ₂ Ph	Me	2- 吡啶基	H
9-97	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	Ph	H
9-98	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	4-Cl-Ph	H
9-99	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	2- 噻吩基	H
9-100	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	3- 噻吩基	H
9-101	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	3-Me-2- 噻吩基	H
9-102	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	4-Me-2- 噻吩基	H
9-103	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	5-Cl-2- 噻吩基	H
9-104	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	5-Me-2- 噻吩基	H

9-105	丙-2-炔-1-基	Me	3-吡啶基	H
9-106	丙-2-炔-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
9-107	丙-2-炔-1-基	H	Ph	H
9-108	丙-2-炔-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-109	丙-2-炔-1-基	Me	4-Me-Ph	H
9-110	丙-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
9-111	丙-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
9-112	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-113	丙-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-114	丙-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-115	丙-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-116	丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-117	丙-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
9-118	丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
9-119	丙-2-炔-1-基	Me	Ph	5-Me

[0973]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
9-120	环丙基甲基	Me	Ph	H
9-121	环丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-122	环丙基甲基	Me	2-噻吩基	H
9-123	环丙基甲基	Me	3-噻吩基	H
9-124	环丙基甲基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
9-125	环丙基甲基	Me	3-吡啶基	H
9-126	环丙基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
9-127	环丙基甲基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
9-128	环丙基甲基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
9-129	环丙基甲基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
9-130	环丙基甲基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
9-131	环丙基甲基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-132	环丙基甲基	Me	4-Me-Ph	H
9-133	环丙基甲基	Me	4-Br-Ph	H
9-134	环丙基甲基	Me	4-F-Ph	H
9-135	环丙基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-136	环丙基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-137	环丙基甲基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-138	环丙基甲基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-139	环丙基甲基	Me	2-吡啶基	H
9-140	环丙基甲基	Me	4-吡啶基	H
9-141	环丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
9-142	环丙基甲基	Me	Ph	5-Me
9-143	环丙基甲基	H	Ph	H
9-144	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
9-145	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-146	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-147	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-148	(1-甲基环丙基)甲基	Me	Ph	H
9-149	(1-甲基环丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-150	(1-甲基环丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H
9-151	(1-甲基环丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H
9-152	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
9-153	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-154	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H

9-155	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-156	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	Ph	H
9-157	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-158	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H

[0974]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
9-159	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H
9-160	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
9-161	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-162	丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-163	丁-2-炔-1-基	Me	3-噻吩基	H
9-164	丁-2-炔-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
9-165	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
9-166	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
9-167	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
9-168	丁-2-炔-1-基	Me	3-吡啶基	H
9-169	丁-2-炔-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
9-170	丁-2-炔-1-基	H	Ph	H
9-171	丁-2-炔-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-172	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-Ph	H
9-173	丁-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
9-174	丁-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
9-175	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-176	丁-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-177	丁-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-178	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-179	丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-180	丁-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
9-181	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
9-182	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	5-Me
9-183	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
9-184	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-185	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-186	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-187	1-环丙基乙基	Me	Ph	H
9-188	1-环丙基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-189	1-环丙基乙基	Me	2-噻吩基	H
9-190	1-环丙基乙基	Me	2-吡啶基	H
9-191	烯丙基	Me	Ph	H
9-192	烯丙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-193	烯丙基	Me	2-噻吩基	H
9-194	烯丙基	Me	2-吡啶基	H
9-195	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H
9-196	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-197	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H

[0975]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
9-198	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-199	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
9-200	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-201	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H

9-202	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-203	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H
9-204	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-205	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-206	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-207	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
9-208	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-209	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-210	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-211	环丁基甲基	Me	Ph	H
9-212	环丁基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-213	环丁基甲基	Me	2-噻吩基	H
9-214	环丁基甲基	Me	2-吡啶基	H
9-215	环戊基甲基	Me	Ph	H
9-216	环戊基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-217	环戊基甲基	Me	2-噻吩基	H
9-218	环戊基甲基	Me	2-吡啶基	H
9-219	环己基甲基	Me	Ph	H
9-220	环己基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-221	环己基甲基	Me	2-噻吩基	H
9-222	环己基甲基	Me	2-吡啶基	H
9-223	丁-3-烯-1-基	Me	Ph	H
9-224	丁-3-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-225	丁-3-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-226	丁-3-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-227	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
9-228	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-229	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-230	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	3-噻吩基	H
9-231	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
9-232	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
9-233	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
9-234	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
9-235	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	3-吡啶基	H
9-236	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H

[0976]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
9-237	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
9-238	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-239	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-Ph	H
9-240	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Br-Ph	H
9-241	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-F-Ph	H
9-242	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-243	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-244	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-245	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-246	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-247	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-吡啶基	H
9-248	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
9-249	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	Ph	5-Me
9-250	2-氯代丙-2-烯-1-基	H	Ph	H
9-251	2-甲氧基乙基	Me	Ph	H

9-252	2-甲氧基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-253	2-甲氧基乙基	Me	2-噻吩基	H
9-254	2-甲氧基乙基	Me	2-吡啶基	H
9-255	四氢呋喃-2-基甲基	Me	Ph	H
9-256	四氢呋喃-2-基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-257	四氢呋喃-2-基甲基	Me	2-噻吩基	H
9-258	四氢呋喃-2-基甲基	Me	2-吡啶基	H
9-259	2-(二甲基氨基)乙基	Me	Ph	H
9-260	2-(二甲基氨基)乙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-261	2-(二甲基氨基)乙基	Me	2-噻吩基	H
9-262	2-(二甲基氨基)乙基	Me	2-吡啶基	H
9-263	氧杂环丁-3-基	Me	Ph	H
9-264	氧杂环丁-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-265	氧杂环丁-3-基	Me	2-噻吩基	H
9-266	氧杂环丁-3-基	Me	2-吡啶基	H
9-267	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	Ph	H
9-268	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-269	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	2-噻吩基	H
9-270	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	2-吡啶基	H
9-271	2,2,2-三氟乙基	Me	Ph	H
9-272	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-273	2,2,2-三氟乙基	Me	2-噻吩基	H
9-274	2,2,2-三氟乙基	Me	3-吡啶基	H
9-275	2,2,2-三氟乙基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H

[0977]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
9-276	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Me-Ph	H
9-277	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
9-278	2,2,2-三氟乙基	Me	4-F-Ph	H
9-279	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-280	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-281	2,2,2-三氟乙基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-282	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-283	2,2,2-三氟乙基	Me	2-吡啶基	H
9-284	2,2,2-三氟乙基	Me	4-吡啶基	H
9-285	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	Ph	H
9-286	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
9-287	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	2-噻吩基	H
9-288	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	3-吡啶基	H
9-289	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-290	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
9-291	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
9-292	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-F-Ph	H
9-293	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-294	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-295	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-296	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-297	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	2-吡啶基	H
9-298	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-吡啶基	H
9-299	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	Ph	H
9-300	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
9-301	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	2-噻吩基	H

9-302	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	3-吡啶基	H
9-303	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-304	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
9-305	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
9-306	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-F-Ph	H
9-307	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-308	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-309	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-310	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-311	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	2-吡啶基	H
9-312	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-吡啶基	H
9-313	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	Ph	H
9-314	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H

[0978]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
9-315	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	2-噻吩基	H
9-316	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	3-吡啶基	H
9-317	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-318	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
9-319	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
9-320	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-F-Ph	H
9-321	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-322	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-323	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-324	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-325	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	2-吡啶基	H
9-326	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-吡啶基	H
9-327	2,2-二氟乙基	Me	Ph	H
9-328	2,2-二氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-329	2,2-二氟乙基	Me	2-噻吩基	H
9-330	2,2-二氟乙基	Me	2-吡啶基	H
9-331	Ph	Me	Ph	H
9-332	Ph	Me	4-Cl-Ph	H
9-333	Ph	Me	2-噻吩基	H
9-334	Ph	Me	2-吡啶基	H
9-335	2-氟乙基	Me	Ph	H
9-336	2-氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-337	2-氟乙基	Me	2-噻吩基	H
9-338	2-氟乙基	Me	2-吡啶基	H
9-339	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	Ph	H
9-340	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-341	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-噻吩基	H
9-342	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-吡啶基	H
9-343	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	Ph	H
9-344	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-345	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	2-噻吩基	H
9-346	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	2-吡啶基	H
9-347	丁-3-炔-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-348	丁-3-炔-2-基	Me	异喹啉-3-基	H
9-349	丁-3-炔-2-基	Me	喹啉-2-基	H
9-350	丁-3-炔-2-基	Me	Ph	H
9-351	丁-3-炔-2-基	Me	4-Cl-Ph	H

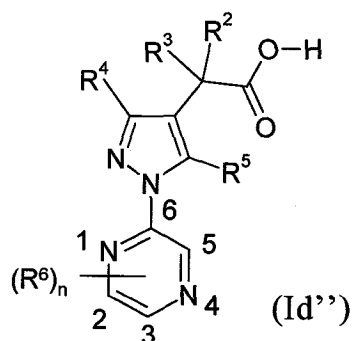
9-352	丁-3-炔-2-基	Me	2-噻吩基	H
9-353	丁-3-炔-2-基	Me	3-吡啶基	H

[0979]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
9-354	丁-3-炔-2-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-355	丁-3-炔-2-基	Me	4-Me-Ph	H
9-356	丁-3-炔-2-基	Me	4-Br-Ph	H
9-357	丁-3-炔-2-基	Me	4-F-Ph	H
9-358	丁-3-炔-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-359	丁-3-炔-2-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-360	丁-3-炔-2-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-361	丁-3-炔-2-基	Me	2-吡啶基	H
9-362	丁-3-炔-2-基	Me	4-吡啶基	H
9-363	Et	Me	异喹啉-3-基	H
9-364	Et	Me	喹啉-2-基	H

[0980] 表 10 : 式 (Id'') 的化合物

[0981]



[0982]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
10-1	H	H	Ph	Ph	H
10-2	H	H	Me	Ph	H
10-3	H	H	Me	5-I-2-噻吩基	H
10-4	H	H	Me	2-呋喃基	H
10-5	H	H	Me	Ph	3-OMe
10-6	Me	H	Me	Ph	5-Me
10-7	H	H	Me	Ph	3-Cl
10-8	H	H	Me	Ph	5-CF ₃
10-9	H	H	Me	Ph	3-CF ₃
10-10	H	H	Me	Ph	5-Me
10-11	H	H	Me	Ph	3,5-Me ₂
10-12	H	H	Me	Ph	3,5-Cl ₂
10-13	H	H	Me	4-MeO-Ph	5-Me
10-14	H	H	Me	4-MeO-Ph	H

[0983]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
10-15	Me	H	Me	Ph	H
10-16	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me
10-17	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Cl
10-18	H	H	Me	4-Me-Ph	H
10-19	H	H	Me	3-Cl-Ph	H

10-20	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	H
10-21	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	5-Me
10-22	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	5-Me
10-23	H	H	Me	3-Cl-Ph	5-Me
10-24	H	H	Me	2-Cl-Ph	5-Me
10-25	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	5-Me
10-26	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	5-Me
10-27	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Me
10-28	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
10-29	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	H
10-30	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	H
10-31	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Cl
10-32	H	H	Me	Ph	5-Cl
10-33	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
10-34	H	H	Me	4-tBu-Ph	5-Me
10-35	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph	5-Me
10-36	H	H	Me	Ph	5-OMe
10-37	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-OMe
10-38	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me
10-39	H	H	Me	4-F-Ph	5-Cl
10-40	H	H	Me	4-F-Ph	5-Me
10-41	H	H	Me	3-Me-Ph	5-Me
10-42	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	5-Me
10-43	H	H	Me	3-Br-Ph	5-Me
10-44	H	H	Me	4-Ph-Ph	5-Me
10-45	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	H
10-46	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph	H
10-47	H	H	Me	Ph	5-SMe
10-48	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SMe
10-49	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H
10-50	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	H
10-51	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	5-Me
10-52	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	5-Me
10-53	H	H	Me	2-吡啶基	5-Cl

[0984]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
10-54	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-F
10-55	H	H	Me	2-噻吩基	5-Me
10-56	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	5-Me
10-57	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	5-Me
10-58	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Me
10-59	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Cl
10-60	H	H	Me	3-噻吩基	5-Me
10-61	H	H	Me	2-噻吩基	H
10-62	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	H
10-63	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	H
10-64	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
10-65	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基	H
10-66	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
10-67	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	H
10-68	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	5-Me
10-69	H	H	Me	3-噻吩基	H

10-70	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-S(O)Me
10-71	H	H	Me	4-Br-Ph	5-Me
10-72	H	H	Me	1,3-苯并二氧杂环戊烯-5-基	5-Me
10-73	H	H	Me	4-I-Ph	5-Me
10-74	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	5-Me
10-75	H	H	Me	4-PhO-Ph	5-Me
10-76	H	H	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
10-77	H	H	Me	Ph	5-S(O)Me
10-78	H	H	H	Ph	H
10-79	H	H	H	Ph	5-Me
10-80	H	H	Et	Ph	H
10-81	H	H	n-Pr	Ph	H
10-82	H	H	CH ₂ Cl	Ph	H
10-83	H	H	CHCl ₂	Ph	H
10-84	H	H	CH ₂ F	Ph	H
10-85	H	H	CHF ₂	Ph	H
10-86	H	H	Cl	Ph	H
10-87	H	H	Et	Ph	5-Me
10-88	H	H	n-Pr	Ph	5-Me
10-89	H	H	CH ₂ Cl	Ph	5-Me
10-90	H	H	CHCl ₂	Ph	5-Me
10-91	H	H	CH ₂ F	Ph	5-Me
10-92	H	H	CHF ₂	Ph	5-Me

[0985]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
10-93	H	H	Cl	Ph	5-Me
10-94	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
10-95	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
10-96	H	H	CH ₂ Cl	4-Cl-Ph	H
10-97	H	H	CHCl ₂	4-Cl-Ph	H
10-98	H	H	CH ₂ F	4-Cl-Ph	H
10-99	H	H	CHF ₂	4-Cl-Ph	H
10-100	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
10-101	H	H	Et	4-Me-Ph	H
10-102	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H
10-103	H	H	CH ₂ Cl	4-Me-Ph	H
10-104	H	H	CHCl ₂	4-Me-Ph	H
10-105	H	H	CH ₂ F	4-Me-Ph	H
10-106	H	H	CHF ₂	4-Me-Ph	H
10-107	H	H	Cl	4-Me-Ph	H
10-108	H	H	Et	2-吡啶基	H
10-109	H	H	n-Pr	2-吡啶基	H
10-110	H	H	CH ₂ Cl	2-吡啶基	H
10-111	H	H	CHCl ₂	2-吡啶基	H
10-112	H	H	CH ₂ F	2-吡啶基	H
10-113	H	H	CHF ₂	2-吡啶基	H
10-114	H	H	Cl	2-吡啶基	H
10-115	H	H	Me	2-吡啶基	H
10-116	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
10-117	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Cl
10-118	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Me
10-119	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

10-120	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Cl
10-121	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Me
10-122	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
10-123	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
10-124	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	5-Me
10-125	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	H
10-126	H	H	Me	4-CH ₂ COOH-Ph	5-Me
10-127	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	5-Me
10-128	H	H	Me	4-Br-Ph	H
10-129	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	H
10-130	H	H	Me	3-Me-Ph	H
10-131	H	H	Me	4-F-Ph	H

[0986]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
10-132	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
10-133	H	H	Me	4-tBu-Ph	H
10-134	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
10-135	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	5-Me
10-136	H	H	Me	3-吡啶基	H
10-137	H	H	Me	4-吡啶基	H
10-138	H	H	C(O)OMe	Ph	H
10-139	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
10-140	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SO ₂ Me
10-141	H	H	Me	3-吡啶基	5-Me
10-142	H	H	Me	2,3-Cl ₂ -Ph	5-Me
10-143	H	H	Me	2-吡啶基	5-Me
10-144	H	H	H	4-Cl-Ph	5-Me
10-145	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
10-146	H	H	Me	Ph	3-Me
10-147	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
10-148	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Me
10-149	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Cl
10-150	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-F
10-151	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H
10-152	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H
10-153	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
10-154	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
10-155	H	H	Me	5-CF ₃ -吡啶-2-基	H
10-156	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
10-157	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
10-158	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
10-159	H	H	CN	4-Cl-Ph	5-Me
10-160	H	H	CN	4-Me-Ph	H
10-161	H	H	CN	4-Me-Ph	5-Me
10-162	H	H	CN	Ph	H
10-163	H	H	CN	Ph	5-Me
10-164	H	H	CN	2-吡啶基	H
10-165	H	H	CN	3-吡啶基	H
10-166	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H
10-167	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H
10-168	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
10-169	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H

10-170	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
--------	---	---	----	-------------	---

[0987]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
10-171	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
10-172	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
10-173	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
10-174	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
10-175	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
10-176	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	H
10-177	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	5-Me
10-178	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	H
10-179	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	5-Me
10-180	H	H	甲酰基	Ph	H
10-181	H	H	甲酰基	Ph	5-Me
10-182	H	H	甲酰基	2-吡啶基	H
10-183	H	H	甲酰基	3-吡啶基	H
10-184	H	H	甲酰基	5-Cl-吡啶-2-基	H
10-185	H	H	甲酰基	5-Br-吡啶-2-基	H
10-186	H	H	甲酰基	5-F-吡啶-2-基	H
10-187	H	H	甲酰基	5-Me-吡啶-2-基	H
10-188	H	H	甲酰基	6-Me-吡啶-3-基	H
10-189	H	H	甲酰基	4-Me-吡啶-2-基	H
10-190	H	H	甲酰基	4-F-吡啶-2-基	H
10-191	H	H	甲酰基	4-Cl-吡啶-2-基	H
10-192	H	H	甲酰基	4-Br-吡啶-2-基	H
10-193	H	H	甲酰基	4-OMe-吡啶-2-基	H
10-194	H	H	CH ₂ OH	5-Me-吡啶-2-基	H
10-195	H	H	CH ₂ OH	4-Cl-Ph	H
10-196	H	H	CH ₂ OH	4-Me-吡啶-2-基	H
10-197	H	H	CH ₂ OH	4-Me-Ph	H
10-198	H	H	CH ₂ OH	Ph	H
10-199	H	H	CH ₂ OH	2-吡啶基	H
10-200	H	H	Me	2-噻唑基	H
10-201	H	H	Me	2-噻唑基	5-Cl
10-202	H	H	Me	2-噻唑基	5-Me
10-203	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
10-204	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Cl
10-205	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Me
10-206	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
10-207	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
10-208	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	5-Me
10-209	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H

[0988]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
10-210	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	H
10-211	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	5-Me
10-212	H	H	Me	2-吡啶基	5-F
10-213	H	H	Me	2-吡嗪基	H
10-214	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
10-215	H	H	Me	2-吡嗪基	5-Me
10-216	H	H	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H

10-217	H	H	Me	1,3- 苯并噻唑 -2- 基	5-Me
10-218	H	H	Me	7-Cl-1,3- 苯并噻唑 -2- 基	H
10-219	H	H	Me	1,5-Me ₂ - 吡唑 -3- 基	H
10-220	H	H	Me	1,5-Me ₂ - 吡唑 -3- 基	5-Me
10-221	H	H	Me	4,5-Me ₂ - 噻唑 -2- 基	H
10-222	H	H	Me	4,5-Cl ₂ - 噻唑 -2- 基	H
10-223	H	H	Me	2- 嘧啶基	H
10-224	H	H	Me	2- 嘧啶基	5-Me
10-225	H	H	Me	5-F- 嘧啶 -2- 基	H
10-226	H	H	Me	5-Cl- 嘧啶 -2- 基	H
10-227	H	H	Me	5-Br- 嘧啶 -2- 基	H
10-228	H	H	Me	5-Me- 嘧啶 -2- 基	H
10-229	H	H	Me	5-Me- 嘧啶 -2- 基	5-Me
10-230	H	H	Me	4,6-Me ₂ - 嘧啶 -2- 基	H
10-231	H	H	Me	4,6-Me ₂ - 嘧啶 -2- 基	5-Me
10-232	H	H	Me	3- 哒嗪基	H
10-233	H	H	Me	6-Me- 哒嗪 -3- 基	H
10-234	H	H	Me	1,2,4- 三嗪 -3- 基	H
10-235	H	H	Me	6-Me-1,2,4- 三嗪 -3- 基	H
10-236	H	H	Me	4-Cl-Ph	2-OMe
10-237	Me	H	Me	2- 吡啶基	2-OMe
10-238	Me	H	Me	4-Cl-Ph	2-OMe
10-239	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	H
10-240	H	H	Me	异喹啉 -3- 基	H
10-241	H	H	Me	喹啉 -2- 基	H

[0989] 此外,还生成了本发明的通式 (I) 化合物的 NMR 数据。示例性化合物的 NMR 各自以在 400MHz (CDCl₃) 下的 ¹H-NMR 谱 (¹H 核磁共振数据) 记录。一些示例性化合物的特征化学位移 δ (ppm) 如下所列:

[0990] NMR 化合物 10-236 (CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm):

[0991] 2.39 (s, 3H) ; 3.23 (s, 3H) ; 3.39 (s, 2H) ; 7.24 (d, 2H) ; 7.38 (d, 2H) ; 8.01 (d, 1H) ; 8.63 (d, 1H)。m. p. :169-171°C。

[0992] NMR 化合物 10-237 (CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm):

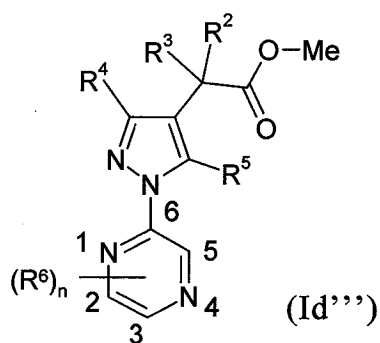
[0993] 1.51 (d, 3H) ; 2.49 (s, 3H) ; 3.29 (s, 3H) ; 3.72 (q, 1H) ; 7.30 (m, 1H) ; 7.46 (m, 1H) ; 7.82 (m, 1H) ; 8.10 (d, 1H) ; 8.64 (d, 1H) ; 8.70 (m, 1H) ; 14.32 (brs, 1H)。

[0994] NMR 化合物 10-238 (CDCl₃, 400MHz, δ 单位为 ppm):

[0995] 1.40 (d, 3H) ; 2.42 (s, 3H) ; 3.24 (s, 3H) ; 3.58 (q, 1H) ; 7.25 (d, 2H) ; 7.38 (d, 2H) ; 7.98 (d, 1H) ; 8.62 (d, 1H)。m. p. :176-178°C。

[0996] 表 11 :式 (Id'") 的化合物

[0997]



[0998]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
11-1	H	H	Ph	Ph	H
11-2	H	H	Me	Ph	H
11-3	H	H	Me	5-I-2-噻吩基	H
11-4	H	H	Me	2-呋喃基	H
11-5	H	H	Me	Ph	3-OMe
11-6	Me	H	Me	Ph	5-Me
11-7	H	H	Me	Ph	3-Cl
11-8	H	H	Me	Ph	5-CF ₃
11-9	H	H	Me	Ph	3-CF ₃
11-10	H	H	Me	Ph	5-Me
11-11	H	H	Me	Ph	3,5-Me ₂

[0999]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
11-12	H	H	Me	Ph	3,5-Cl ₂
11-13	H	H	Me	4-MeO-Ph	5-Me
11-14	H	H	Me	4-MeO-Ph	H
11-15	Me	H	Me	Ph	H
11-16	H	H	Me	4-Me-Ph	H
11-17	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me
11-18	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Cl
11-19	H	H	Me	3-Cl-Ph	H
11-20	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	H
11-21	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph	5-Me
11-22	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	5-Me
11-23	H	H	Me	3-Cl-Ph	5-Me
11-24	H	H	Me	2-Cl-Ph	5-Me
11-25	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	5-Me
11-26	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	5-Me
11-27	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Me
11-28	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
11-29	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	H
11-30	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph	H
11-31	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Cl
11-32	H	H	Me	Ph	5-Cl
11-33	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
11-34	H	H	Me	4-tBu-Ph	5-Me
11-35	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph	5-Me
11-36	H	H	Me	Ph	5-OMe
11-37	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-OMe
11-38	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me

11-39	H	H	Me	4-F-Ph	5-Me
11-40	H	H	Me	4-F-Ph	5-Cl
11-41	H	H	Me	3-Me-Ph	5-Me
11-42	H	H	Me	4-COOH-Ph	5-Me
11-43	H	H	Me	3-Br-Ph	5-Me
11-44	H	H	Me	4-Ph-Ph	5-Me
11-45	H	H	Me	4-COOH-Ph	H
11-46	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph	H
11-47	H	H	Me	Ph	5-SMe
11-48	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SMe
11-49	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H
11-50	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	H

[1000]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
11-51	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph	5-Me
11-52	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	5-Me
11-53	H	H	Me	2-吡啶基	5-Cl
11-54	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-F
11-55	H	H	Me	2-噻吩基	5-Me
11-56	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	5-Me
11-57	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	5-Me
11-58	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Me
11-59	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Cl
11-60	H	H	Me	3-噻吩基	5-Me
11-61	H	H	Me	2-噻吩基	H
11-62	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	H
11-63	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	H
11-64	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
11-65	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基	H
11-66	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
11-67	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	H
11-68	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	5-Me
11-69	H	H	Me	3-噻吩基	H
11-70	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-S(O)Me
11-71	H	H	Me	4-Br-Ph	5-Me
11-72	H	H	Me	1,3-苯并二氧杂环戊烯-5-基	5-Me
11-73	H	H	Me	4-I-Ph	5-Me
11-74	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	5-Me
11-75	H	H	Me	4-PhO-Ph	5-Me
11-76	H	H	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
11-77	H	H	Me	Ph	5-S(O)Me
11-78	H	H	H	Ph	H
11-79	H	H	H	Ph	5-Me
11-80	H	H	Et	Ph	H
11-81	H	H	n-Pr	Ph	H
11-82	H	H	CH ₂ Cl	Ph	H
11-83	H	H	CHCl ₂	Ph	H
11-84	H	H	CH ₂ F	Ph	H
11-85	H	H	CHF ₂	Ph	H
11-86	H	H	Cl	Ph	H
11-87	H	H	Et	Ph	5-Me
11-88	H	H	n-Pr	Ph	5-Me

11-89	H	H	CH ₂ Cl	Ph	5-Me
-------	---	---	--------------------	----	------

[1001]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
11-90	H	H	CHCl ₂	Ph	5-Me
11-91	H	H	CH ₂ F	Ph	5-Me
11-92	H	H	CHF ₂	Ph	5-Me
11-93	H	H	Cl	Ph	5-Me
11-94	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
11-95	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
11-96	H	H	CH ₂ Cl	4-Cl-Ph	H
11-97	H	H	CHCl ₂	4-Cl-Ph	H
11-98	H	H	CH ₂ F	4-Cl-Ph	H
11-99	H	H	CHF ₂	4-Cl-Ph	H
11-100	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
11-101	H	H	Et	4-Me-Ph	H
11-102	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H
11-103	H	H	CH ₂ Cl	4-Me-Ph	H
11-104	H	H	CHCl ₂	4-Me-Ph	H
11-105	H	H	CH ₂ F	4-Me-Ph	H
11-106	H	H	CHF ₂	4-Me-Ph	H
11-107	H	H	Cl	4-Me-Ph	H
11-108	H	H	Et	2-吡啶基	H
11-109	H	H	n-Pr	2-吡啶基	H
11-110	H	H	CH ₂ Cl	2-吡啶基	H
11-111	H	H	CHCl ₂	2-吡啶基	H
11-112	H	H	CH ₂ F	2-吡啶基	H
11-113	H	H	CHF ₂	2-吡啶基	H
11-114	H	H	Cl	2-吡啶基	H
11-115	H	H	Me	2-吡啶基	H
11-116	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
11-117	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Cl
11-118	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Me
11-119	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
11-120	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Cl
11-121	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Me
11-122	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
11-123	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
11-124	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	5-Me
11-125	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	H
11-126	H	H	Me	4-(CH ₂ COOH)-Ph	5-Me
11-127	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	5-Me
11-128	H	H	Me	4-Br-Ph	5-Me

[1002]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
11-129	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	H
11-130	H	H	Me	3-Me-Ph	H
11-131	H	H	Me	4-F-Ph	H
11-132	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
11-133	H	H	Me	4-tBu-Ph	H
11-134	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
11-135	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	5-Me

11-136	H	H	Me	3-吡啶基	H
11-137	H	H	Me	4-吡啶基	H
11-138	H	H	C(O)OMe	Ph	H
11-139	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
11-140	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SO ₂ Me
11-141	H	H	Me	3-吡啶基	5-Me
11-142	H	H	Me	2,3-Cl ₂ -Ph	5-Me
11-143	H	H	Me	2-吡啶基	5-Me
11-144	H	H	H	4-Cl-Ph	5-Me
11-145	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
11-146	H	H	Me	Ph	5-Me
11-147	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
11-148	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Me
11-149	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Cl
11-150	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-F
11-151	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H
11-152	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H
11-153	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
11-154	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
11-155	H	H	Me	5-CF ₃ -吡啶-2-基	H
11-156	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
11-157	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
11-158	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
11-159	H	H	CN	4-Cl-Ph	5-Me
11-160	H	H	CN	4-Me-Ph	H
11-161	H	H	CN	4-Me-Ph	5-Me
11-162	H	H	CN	Ph	H
11-163	H	H	CN	Ph	5-Me
11-164	H	H	CN	2-吡啶基	H
11-165	H	H	CN	3-吡啶基	H
11-166	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H
11-167	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H

[1003]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
11-168	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
11-169	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H
11-170	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
11-171	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
11-172	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
11-173	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
11-174	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
11-175	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
11-176	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	H
11-177	H	H	甲酰基	4-Cl-Ph	5-Me
11-178	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	H
11-179	H	H	甲酰基	4-Me-Ph	5-Me
11-180	H	H	甲酰基	Ph	H
11-181	H	H	甲酰基	Ph	5-Me
11-182	H	H	甲酰基	2-吡啶基	H
11-183	H	H	甲酰基	3-吡啶基	H
11-184	H	H	甲酰基	5-Cl-吡啶-2-基	H
11-185	H	H	甲酰基	5-Br-吡啶-2-基	H

11-186	H	H	甲酰基	5-F-吡啶-2-基	H
11-187	H	H	甲酰基	5-Me-吡啶-2-基	H
11-188	H	H	甲酰基	6-Me-吡啶-3-基	H
11-189	H	H	甲酰基	4-Me-吡啶-2-基	H
11-190	H	H	甲酰基	4-F-吡啶-2-基	H
11-191	H	H	甲酰基	4-Cl-吡啶-2-基	H
11-192	H	H	甲酰基	4-Br-吡啶-2-基	H
11-193	H	H	甲酰基	4-OMe-吡啶-2-基	H
11-194	H	H	CH ₂ OH	5-Me-吡啶-2-基	H
11-195	H	H	CH ₂ OH	4-Cl-Ph	H
11-196	H	H	CH ₂ OH	4-Me-吡啶-2-基	H
11-197	H	H	CH ₂ OH	4-Me-Ph	H
11-198	H	H	CH ₂ OH	Ph	H
11-199	H	H	CH ₂ OH	2-吡啶基	H
11-200	H	H	Me	2-噻唑基	H
11-201	H	H	Me	2-噻唑基	5-Cl
11-202	H	H	Me	2-噻唑基	5-Me
11-203	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
11-204	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Cl
11-205	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Me
11-206	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H

[1004]

编号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
11-207	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
11-208	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	5-Me
11-209	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
11-210	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	H
11-211	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	5-Me
11-212	H	H	Me	2-吡啶基	5-F
11-213	H	H	Me	2-吡啶基	H
11-214	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
11-215	H	H	Me	2-吡啶基	5-Me
11-216	H	H	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H
11-217	H	H	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	5-Me
11-218	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
11-219	H	H	Me	1,5-Me ₂ -吡啶-3-基	H
11-220	H	H	Me	1,5-Me ₂ -吡啶-3-基	5-Me
11-221	H	H	Me	4,5-Me ₂ -噻唑-2-基	H
11-222	H	H	Me	4,5-Cl ₂ -噻唑-2-基	H
11-223	H	H	Me	2-嘧啶基	H
11-224	H	H	Me	2-嘧啶基	5-Me
11-225	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
11-226	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
11-227	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
11-228	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
11-229	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	5-Me
11-230	H	H	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基	H
11-231	H	H	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基	5-Me
11-232	H	H	Me	3-哒嗪基	H
11-233	H	H	Me	6-Me-哒嗪-3-基	H
11-234	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基	H
11-235	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H

11-236	Me	H	Me	2-吡啶基	2-Cl
11-237	H	H	Me	4-Cl-Ph	2-Cl
11-238	Me	H	Me	4-Cl-Ph	2-Cl
11-239	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	H
11-240	H	H	Me	异喹啉-3-基	H
11-241	H	H	Me	喹啉-2-基	H

[1005] 此外,还生成了本发明的通式(I)化合物的NMR数据。示例性化合物的NMR各自以在400MHz(CDCl₃)下的¹H-NMR谱(¹H核磁共振数据)记录。一些示例性化合物的特征化学位移δ(ppm)如下所列:

[1006] NMR化合物11-236(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[1007] 1.42(d,3H);2.39(s,3H);3.65(s,3H);3.72(q,1H);7.35(m,1H);7.44(m,1H);7.80(m,1H);8.31(m,1H);8.61(m,1H);8.98(m,1H)。

[1008] NMR化合物11-28(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[1009] 2.37(s,3H);3.38(s,2H);3.70(s,3H);7.20(d,2H);7.36(d,2H);8.17(dd,1H);8.38(d,1H);8.86(d,1H)。

[1010] NMR化合物11-237(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

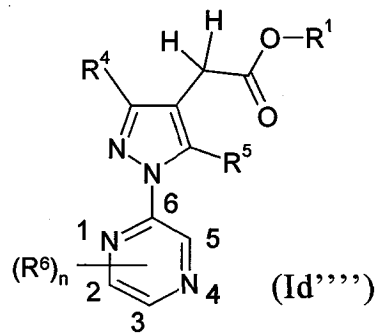
[1011] 2.36(s,3H);3.36(s,2H);3.69(s,3H);7.22(d,2H);7.39(d,2H);8.34(d,1H);8.85(d,1H)。m.p.:126-128°C。

[1012] NMR化合物11-238(CDCl₃,400MHz,δ单位为ppm):

[1013] 1.40(d,3H);2.37(s,3H);3.56(q,1H);3.68(s,3H);7.22(d,2H);7.40(d,2H);8.33(d,1H);8.82(d,1H)。

[1014] 表12:式(Id''')的化合物

[1015]



[1016]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
12-1	Et	Me	Ph	H
12-2	Et	Me	Ph	5-Me
12-3	Et	Me	3-Cl-Ph	H
12-4	Et	Me	4-Cl-Ph	H
12-5	Et	Me	4-Cl-Ph	5-Me

[1017]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
12-6	Et	Me	2-噻吩基	H
12-7	Et	Me	3-噻吩基	H
12-8	Et	Me	3-Me-2-噻吩基	H
12-9	Et	Me	4-Me-2-噻吩基	H

12-10	Et	Me	5-Br-2-噻吩基	H
12-11	Et	Me	5-Br-2-噻吩基	5-Me
12-12	Et	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
12-13	Et	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Me
12-14	Et	Me	5-I-2-噻吩基	H
12-15	Et	Me	5-Me-2-噻吩基	H
12-16	Et	Me	3-吡啶基	H
12-17	Et	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
12-18	Et	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
12-19	Et	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-20	Et	Me	4-Me-Ph	H
12-21	Et	Me	4-Me-Ph	5-Me
12-22	Et	Me	4-Br-Ph	H
12-23	Et	Me	4-F-Ph	H
12-24	Et	Me	4-F-Ph	5-Me
12-25	Et	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-26	Et	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-27	Et	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-28	Et	Me	5-F-吡啶-2-基	5-Me
12-29	Et	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Me
12-30	Et	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Me
12-31	Et	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-32	Et	Me	5-Me-吡啶-2-基	5-Me
12-33	Et	Me	2-吡啶基	5-Me
12-34	Et	Me	2-吡啶基	H
12-35	Et	Me	4-吡啶基	H
12-36	Et	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
12-37	Et	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Me
12-38	Et	Me	2-噻唑基	H
12-39	Et	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
12-40	Et	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
12-41	Et	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
12-42	Et	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
12-43	Et	Me	4,5-Me ₂ -噻唑-2-基	H
12-44	Et	Me	4,5-Cl ₂ -噻唑-2-基	H

[1018]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
12-45	Et	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基	H
12-46	Et	Me	2-吡嗪基	H
12-47	Et	Me	2-嘧啶基	H
12-48	Et	Me	2-嘧啶基	5-Me
12-49	Et	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
12-50	Et	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
12-51	Et	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
12-52	Et	Me	5-Me-嘧啶-2-基	5-Me
12-53	Et	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基	H
12-54	Et	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基	5-Me
12-55	Et	Me	1,3-苯并噻唑-2-基	H
12-56	Et	Me	7-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基	H
12-57	Et	Me	1,5-Me ₂ -吡唑-3-基	H
12-58	Et	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
12-59	Et	Me	5-F-嘧啶-2-基	H

12-60	Et	Me	4,6-Me ₂ - 嘧啶 -2- 基	H
12-61	Et	Me	3- 哒嗪基	H
12-62	Et	Me	6-Me- 哒嗪 -3- 基	H
12-63	Et	Me	1,2,4- 三嗪 -3- 基	H
12-64	Et	Me	6-Me-1,2,4- 三嗪 -3- 基	H
12-65	Pr	Me	Ph	H
12-66	Pr	Me	4-Cl-Ph	H
12-67	Pr	Me	2- 噁吩基	H
12-68	Pr	Me	3- 吡啶基	H
12-69	Pr	Me	6-Me- 吡啶 -3- 基	H
12-70	Pr	Me	4-Me-Ph	H
12-71	Pr	Me	4-Br-Ph	H
12-72	Pr	Me	4-F-Ph	H
12-73	Pr	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
12-74	Pr	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
12-75	Pr	Me	5-F- 吡啶 -2- 基	H
12-76	Pr	Me	5-Me- 吡啶 -2- 基	H
12-77	Pr	Me	2- 吡啶基	H
12-78	Pr	Me	4- 吡啶基	H
12-79	i-Pr	Me	Ph	H
12-80	i-Pr	Me	4-Cl-Ph	H
12-81	i-Pr	Me	2- 噁吩基	H
12-82	i-Pr	Me	3- 吡啶基	H
12-83	i-Pr	Me	6-Me- 吡啶 -3- 基	H

[1019]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
12-84	i-Pr	Me	4-Me-Ph	H
12-85	i-Pr	Me	4-Br-Ph	H
12-86	i-Pr	Me	4-F-Ph	H
12-87	i-Pr	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基	H
12-88	i-Pr	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基	H
12-89	i-Pr	Me	5-F- 吡啶 -2- 基	H
12-90	i-Pr	Me	5-Me- 吡啶 -2- 基	H
12-91	i-Pr	Me	2- 吡啶基	H
12-92	i-Pr	Me	4- 吡啶基	H
12-93	CH ₂ Ph	Me	Ph	H
12-94	CH ₂ Ph	Me	4-Cl-Ph	H
12-95	CH ₂ Ph	Me	2- 噁吩基	H
12-96	CH ₂ Ph	Me	2- 吡啶基	H
12-97	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	Ph	H
12-98	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	4-Cl-Ph	H
12-99	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	2- 噁吩基	H
12-100	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	3- 噁吩基	H
12-101	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	3-Me-2- 噁吩基	H
12-102	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	4-Me-2- 噁吩基	H
12-103	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	5-Cl-2- 噁吩基	H
12-104	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	5-Me-2- 噁吩基	H
12-105	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	3- 吡啶基	H
12-106	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	6-MeO- 吡啶 -3- 基	H
12-107	丙 -2- 炔 -1- 基	H	Ph	H
12-108	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	6-Me- 吡啶 -3- 基	H
12-109	丙 -2- 炔 -1- 基	Me	4-Me-Ph	H

12-110	丙-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
12-111	丙-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
12-112	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-113	丙-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-114	丙-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-115	丙-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-116	丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-117	丙-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
12-118	丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
12-119	丙-2-炔-1-基	Me	Ph	5-Me
12-120	环丙基甲基	Me	Ph	H
12-121	环丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-122	环丙基甲基	Me	2-噻吩基	H

[1020]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
12-123	环丙基甲基	Me	3-噻吩基	H
12-124	环丙基甲基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
12-125	环丙基甲基	Me	3-吡啶基	H
12-126	环丙基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
12-127	环丙基甲基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
12-128	环丙基甲基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
12-129	环丙基甲基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
12-130	环丙基甲基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
12-131	环丙基甲基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-132	环丙基甲基	Me	4-Me-Ph	H
12-133	环丙基甲基	Me	4-Br-Ph	H
12-134	环丙基甲基	Me	4-F-Ph	H
12-135	环丙基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-136	环丙基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-137	环丙基甲基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-138	环丙基甲基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-139	环丙基甲基	Me	2-吡啶基	H
12-140	环丙基甲基	Me	4-吡啶基	H
12-141	环丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
12-142	环丙基甲基	Me	Ph	5-Me
12-143	环丙基甲基	H	Ph	H
12-144	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
12-145	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-146	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-147	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-148	(1-甲基环丙基)甲基	Me	Ph	H
12-149	(1-甲基环丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-150	(1-甲基环丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H
12-151	(1-甲基环丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H
12-152	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
12-153	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-154	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-155	4-氯代丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-156	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	Ph	H
12-157	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-158	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H
12-159	(2,2-二氯环丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H

12-160	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
12-161	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H

[1021]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
12-162	丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-163	丁-2-炔-1-基	Me	3-噻吩基	H
12-164	丁-2-炔-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
12-165	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
12-166	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
12-167	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
12-168	丁-2-炔-1-基	Me	3-吡啶基	H
12-169	丁-2-炔-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
12-170	丁-2-炔-1-基	H	Ph	H
12-171	丁-2-炔-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-172	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-Ph	H
12-173	丁-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
12-174	丁-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
12-175	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-176	丁-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-177	丁-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-178	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-179	丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-180	丁-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
12-181	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
12-182	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	5-Me
12-183	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
12-184	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-185	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-186	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-187	1-环丙基乙基	Me	Ph	H
12-188	1-环丙基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
12-189	1-环丙基乙基	Me	2-噻吩基	H
12-190	1-环丙基乙基	Me	2-吡啶基	H
12-191	烯丙基	Me	Ph	H
12-192	烯丙基	Me	4-Cl-Ph	H
12-193	烯丙基	Me	2-噻吩基	H
12-194	烯丙基	Me	2-吡啶基	H
12-195	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H
12-196	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-197	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-198	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-199	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
12-200	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H

[1022]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
12-201	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-202	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-203	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H
12-204	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-205	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-206	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H

12-207	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
12-208	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-209	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-210	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-211	环丁基甲基	Me	Ph	H
12-212	环丁基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-213	环丁基甲基	Me	2-噻吩基	H
12-214	环丁基甲基	Me	2-吡啶基	H
12-215	环戊基甲基	Me	Ph	H
12-216	环戊基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-217	环戊基甲基	Me	2-噻吩基	H
12-218	环戊基甲基	Me	2-吡啶基	H
12-219	环己基甲基	Me	Ph	H
12-220	环己基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-221	环己基甲基	Me	2-噻吩基	H
12-222	环己基甲基	Me	2-吡啶基	H
12-223	丁-3-烯-1-基	Me	Ph	H
12-224	丁-3-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-225	丁-3-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-226	丁-3-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-227	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
12-228	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-229	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-230	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	3-噻吩基	H
12-231	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
12-232	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
12-233	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
12-234	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
12-235	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	3-吡啶基	H
12-236	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
12-237	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
12-238	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-239	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-Ph	H

[1023]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
12-240	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Br-Ph	H
12-241	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-F-Ph	H
12-242	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-243	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-244	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-245	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-246	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-247	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-吡啶基	H
12-248	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
12-249	2-氯代丙-2-烯-1-基	Me	Ph	5-Me
12-250	2-氯代丙-2-烯-1-基	H	Ph	H
12-251	2-甲氧基乙基	Me	Ph	H
12-252	2-甲氧基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
12-253	2-甲氧基乙基	Me	2-噻吩基	H
12-254	2-甲氧基乙基	Me	2-吡啶基	H
12-255	四氢呋喃-2-基甲基	Me	Ph	H
12-256	四氢呋喃-2-基甲基	Me	4-Cl-Ph	H

12-257	四氢呋喃-2-基甲基	Me	2-噻吩基	H
12-258	四氢呋喃-2-基甲基	Me	2-吡啶基	H
12-259	2-(二甲基氨基)乙基	Me	Ph	H
12-260	2-(二甲基氨基)乙基	Me	4-Cl-Ph	H
12-261	2-(二甲基氨基)乙基	Me	2-噻吩基	H
12-262	2-(二甲基氨基)乙基	Me	2-吡啶基	H
12-263	氧杂环丁-3-基	Me	Ph	H
12-264	氧杂环丁-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-265	氧杂环丁-3-基	Me	2-噻吩基	H
12-266	氧杂环丁-3-基	Me	2-吡啶基	H
12-267	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	Ph	H
12-268	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-269	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	2-噻吩基	H
12-270	(3-甲基氧杂环丁-3-基)甲基	Me	2-吡啶基	H
12-271	2,2,2-三氟乙基	Me	Ph	H
12-272	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
12-273	2,2,2-三氟乙基	Me	2-噻吩基	H
12-274	2,2,2-三氟乙基	Me	3-吡啶基	H
12-275	2,2,2-三氟乙基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-276	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Me-Ph	H
12-277	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
12-278	2,2,2-三氟乙基	Me	4-F-Ph	H

[1024]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
12-279	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-280	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-281	2,2,2-三氟乙基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-282	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-283	2,2,2-三氟乙基	Me	2-吡啶基	H
12-284	2,2,2-三氟乙基	Me	4-吡啶基	H
12-285	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	Ph	H
12-286	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
12-287	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	2-噻吩基	H
12-288	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	3-吡啶基	H
12-289	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-290	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
12-291	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
12-292	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-F-Ph	H
12-293	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-294	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-295	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-296	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-297	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	2-吡啶基	H
12-298	CH ₂ (4-Cl-Ph)	Me	4-吡啶基	H
12-299	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	Ph	H
12-300	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
12-301	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	2-噻吩基	H
12-302	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	3-吡啶基	H
12-303	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-304	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
12-305	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
12-306	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-F-Ph	H

12-307	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-308	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-309	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-310	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-311	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	2-吡啶基	H
12-312	CH ₂ (4-F-Ph)	Me	4-吡啶基	H
12-313	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	Ph	H
12-314	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
12-315	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	2-噻吩基	H
12-316	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	3-吡啶基	H
12-317	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H

[1025]

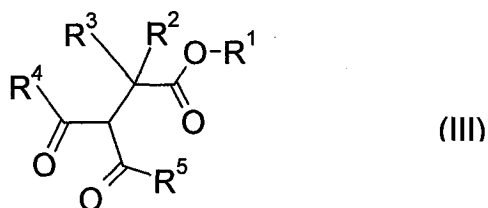
编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
12-318	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
12-319	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
12-320	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-F-Ph	H
12-321	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-322	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-323	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-324	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-325	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	2-吡啶基	H
12-326	CH ₂ (4-OMe-Ph)	Me	4-吡啶基	H
12-327	2,2-二氟乙基	Me	Ph	H
12-328	2,2-二氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
12-329	2,2-二氟乙基	Me	2-噻吩基	H
12-330	2,2-二氟乙基	Me	2-吡啶基	H
12-331	Ph	Me	Ph	H
12-332	Ph	Me	4-Cl-Ph	H
12-333	Ph	Me	2-噻吩基	H
12-334	Ph	Me	2-吡啶基	H
12-335	2-氟乙基	Me	Ph	H
12-336	2-氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
12-337	2-氟乙基	Me	2-噻吩基	H
12-338	2-氟乙基	Me	2-吡啶基	H
12-339	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	Ph	H
12-340	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
12-341	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-噻吩基	H
12-342	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-吡啶基	H
12-343	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	Ph	H
12-344	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-345	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	2-噻吩基	H
12-346	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	2-吡啶基	H
12-347	丁-3-炔-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-348	丁-3-炔-2-基	Me	异喹啉-3-基	H
12-349	丁-3-炔-2-基	Me	喹啉-2-基	H
12-350	丁-3-炔-2-基	Me	Ph	H
12-351	丁-3-炔-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-352	丁-3-炔-2-基	Me	2-噻吩基	H
12-353	丁-3-炔-2-基	Me	3-吡啶基	H
12-354	丁-3-炔-2-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-355	丁-3-炔-2-基	Me	4-Me-Ph	H
12-356	丁-3-炔-2-基	Me	4-Br-Ph	H

[1026]

编号	R ¹	R ⁴	R ⁵	(R ⁶) _n
12-357	丁-3-炔-2-基	Me	4-F-Ph	H
12-358	丁-3-炔-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-359	丁-3-炔-2-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-360	丁-3-炔-2-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-361	丁-3-炔-2-基	Me	2-吡啶基	H
12-362	丁-3-炔-2-基	Me	4-吡啶基	H
12-363	Et	Me	异喹啉-3-基	H
12-364	Et	Me	喹啉-2-基	H

[1027] 表 13 :式 (III) 的化合物 (中间体)

[1028]



[1029]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
13-1	Me	H	H	Ph	Ph
13-2	Me	H	H	Me	Ph
13-3	Me	H	H	Me	2-呋喃基
13-4	Me	Me	H	Me	Ph
13-5	Me	H	H	Me	4-MeO-Ph
13-6	Me	H	H	Me	4-Me-Ph
13-7	Me	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph
13-8	Me	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph
13-9	Me	H	H	Me	3-Cl-Ph
13-10	Me	H	H	Me	2-Cl-Ph
13-11	Me	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph
13-12	Me	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph
13-13	Me	H	H	Me	4-Cl-Ph
13-14	Me	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph
13-15	Me	H	H	Me	4-tBu-Ph
13-16	Me	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph
13-17	Me	H	H	Me	4-Me-Ph
13-18	Me	H	H	Me	4-F-Ph
13-19	Me	H	H	Me	3-Me-Ph

[1030]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
13-20	Me	H	H	Me	4-COOH-Ph
13-21	Me	H	H	Me	3-Br-Ph
13-22	Me	H	H	Me	4-Ph-Ph
13-23	Me	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph
13-24	Me	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph
13-25	Me	H	H	Me	2-噻吩基
13-26	Me	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基
13-27	Me	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基
13-28	Me	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基
13-29	Me	H	H	Me	5-I-2-噻吩基

13-30	Me	H	H	Me	3- 噻吩基
13-31	Me	H	H	Me	3- 吡啶基
13-32	Me	H	H	Me	5-Me-2- 噻吩基
13-33	Me	H	H	Me	6-MeO- 吡啶 -3- 基
13-34	Me	H	H	Me	5-Br-2- 噻吩基
13-35	Me	H	H	Me	4-Br-Ph
13-36	Me	H	H	Me	1,3- 苯并二氧杂环戊烯 -5- 基
13-37	Me	H	H	Me	4-I-Ph
13-38	Me	H	H	Me	4-PhO-Ph
13-39	Me	H	H	Me	6-OH- 吡啶 -3- 基
13-40	Me	H	H	H	Ph
13-41	Me	H	H	Et	Ph
13-42	Me	H	H	n-Pr	Ph
13-43	Me	H	H	CH ₂ Cl	Ph
13-44	Me	H	H	CHCl ₂	Ph
13-45	Me	H	H	CH ₂ F	Ph
13-46	Me	H	H	CHF ₂	Ph
13-47	Me	H	H	Cl	Ph
13-48	Me	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph
13-49	Me	H	H	CH ₂ Cl	4-Cl-Ph
13-50	Me	H	H	CHCl ₂	4-Cl-Ph
13-51	Me	H	H	CH ₂ F	4-Cl-Ph
13-52	Me	H	H	CHF ₂	4-Cl-Ph
13-53	Me	H	H	Cl	4-Cl-Ph
13-54	Me	H	H	Et	4-Me-Ph
13-55	Me	H	H	n-Pr	4-Me-Ph
13-56	Me	H	H	CH ₂ Cl	4-Me-Ph

[1031]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
13-57	Me	H	H	CHCl ₂	4-Me-Ph
13-58	Me	H	H	CH ₂ F	4-Me-Ph
13-59	Me	H	H	CHF ₂	4-Me-Ph
13-60	Me	H	H	Cl	4-Me-Ph
13-61	Me	H	H	Et	2- 吡啶基
13-62	Me	H	H	n-Pr	2- 吡啶基
13-63	Me	H	H	CH ₂ Cl	2- 吡啶基
13-64	Me	H	H	CHCl ₂	2- 吡啶基
13-65	Me	H	H	CH ₂ F	2- 吡啶基
13-66	Me	H	H	CHF ₂	2- 吡啶基
13-67	Me	H	H	Cl	2- 吡啶基
13-68	Me	H	H	Me	2- 吡啶基
13-69	Me	H	H	Me	5-Cl- 吡啶 -2- 基
13-70	Me	H	H	Me	5-Br- 吡啶 -2- 基
13-71	Me	H	H	Me	5-F- 吡啶 -2- 基
13-72	Me	H	H	Me	5-Me- 吡啶 -2- 基
13-73	Me	H	H	Me	4-Me- 吡啶 -2- 基
13-74	Me	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph
13-75	Me	H	H	Me	4-CH ₂ COOH-Ph
13-76	Me	H	H	Me	4-(MeCO)-Ph
13-77	Me	H	H	Me	4-tBu-Ph
13-78	Me	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph
13-79	Me	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph

13-80	Me	H	H	Me	3-吡啶基
13-81	Me	H	H	Me	4-吡啶基
13-82	Me	H	H	C(O)OMe	Ph
13-83	Me	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基
13-84	Me	H	H	Me	2,3-Cl ₂ -Ph
13-85	Me	H	H	H	4-Cl-Ph
13-86	Me	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基
13-87	Me	H	H	Me	2-噻唑基
13-88	Me	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基
13-89	Me	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基
13-90	Me	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基
13-91	Me	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基
13-92	Me	H	H	Me	4,5-Me ₂ -噻唑-2-基
13-93	Me	H	H	Me	4,5-Cl ₂ -噻唑-2-基

[1032]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
13-94	Me	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基
13-95	Me	H	H	Me	2-吡嗪基
13-96	Me	H	H	Me	2-嘧啶基
13-97	Me	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基
13-98	Me	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基
13-99	Me	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基
13-100	Me	H	H	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基
13-101	Me	H	H	Me	1,3-苯并噻唑-2-基
13-102	Me	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基
13-103	Me	H	H	Me	1,5-Me ₂ -吡唑-3-基
13-104	Me	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基
13-105	Me	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基
13-106	Me	H	H	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基
13-107	Me	H	H	Me	3-哒嗪基
13-108	Me	H	H	Me	6-Me-哒嗪-3-基
13-109	Me	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基
13-110	Me	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基
13-111	Et	H	H	Ph	Ph
13-112	Et	H	H	Me	Ph
13-113	Et	H	H	Me	2-咪唑基
13-114	Et	Me	H	Me	Ph
13-115	Et	H	H	Me	4-MeO-Ph
13-116	Et	H	H	Me	4-Me-Ph
13-117	Et	H	H	Me	3-CF ₃ -Ph
13-118	Et	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph
13-119	Et	H	H	Me	3-Cl-Ph
13-120	Et	H	H	Me	2-Cl-Ph
13-121	Et	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph
13-122	Et	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph
13-123	Et	H	H	Me	4-Cl-Ph
13-124	Et	H	H	Me	4-CF ₃ -Ph
13-125	Et	H	H	Me	4-tBu-Ph
13-126	Et	H	H	Me	3,5-Me ₂ -Ph
13-127	Et	H	H	Me	4-Me-Ph
13-128	Et	H	H	Me	4-F-Ph
13-129	Et	H	H	Me	3-Me-Ph

13-130	Et	H	H	Me	4-COOH-Ph
--------	----	---	---	----	-----------

[1033]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
13-131	Et	H	H	Me	3-Br-Ph
13-132	Et	H	H	Me	4-Ph-Ph
13-133	Et	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph
13-134	Et	H	H	Me	3-CF ₃ -4-Cl-Ph
13-135	Et	H	H	Me	2-噻吩基
13-136	Et	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基
13-137	Et	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基
13-138	Et	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基
13-139	Et	H	H	Me	5-I-2-噻吩基
13-140	Et	H	H	Me	3-噻吩基
13-141	Et	H	H	Me	3-吡啶基
13-142	Et	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基
13-143	Et	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基
13-144	Et	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基
13-145	Et	H	H	Me	4-Br-Ph
13-146	Et	H	H	Me	1,3-苯并二氧杂环戊烯-5-基
13-147	Et	H	H	Me	4-I-Ph
13-148	Et	H	H	Me	4-PhO-Ph
13-149	Et	H	H	Me	6-OH-吡啶-3-基
13-150	Et	H	H	H	Ph
13-151	Et	H	H	Et	Ph
13-152	Et	H	H	n-Pr	Ph
13-153	Et	H	H	CH ₂ Cl	Ph
13-154	Et	H	H	CHCl ₂	Ph
13-155	Et	H	H	CH ₂ F	Ph
13-156	Et	H	H	CHF ₂	Ph
13-157	Et	H	H	Cl	Ph
13-158	Et	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph
13-159	Et	H	H	CH ₂ Cl	4-Cl-Ph
13-160	Et	H	H	CHCl ₂	4-Cl-Ph
13-161	Et	H	H	CH ₂ F	4-Cl-Ph
13-162	Et	H	H	CHF ₂	4-Cl-Ph
13-163	Et	H	H	Cl	4-Cl-Ph
13-164	Et	H	H	Et	4-Me-Ph
13-165	Et	H	H	n-Pr	4-Me-Ph
13-166	Et	H	H	CH ₂ Cl	4-Me-Ph
13-167	Et	H	H	CHCl ₂	4-Me-Ph

[1034]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
13-168	Et	H	H	CH ₂ F	4-Me-Ph
13-169	Et	H	H	CHF ₂	4-Me-Ph
13-170	Et	H	H	Cl	4-Me-Ph
13-171	Et	H	H	Et	2-吡啶基
13-172	Et	H	H	n-Pr	2-吡啶基
13-173	Et	H	H	CH ₂ Cl	2-吡啶基
13-174	Et	H	H	CHCl ₂	2-吡啶基
13-175	Et	H	H	CH ₂ F	2-吡啶基
13-176	Et	H	H	CHF ₂	2-吡啶基
13-177	Et	H	H	Cl	2-吡啶基

13-178	Et	H	H	Me	2-吡啶基
13-179	Et	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基
13-180	Et	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基
13-181	Et	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基
13-182	Et	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基
13-183	Et	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基
13-184	Et	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph
13-185	Et	H	H	Me	4-CH ₂ COOH-Ph
13-186	Et	H	H	Me	4-(MeCO)-Ph
13-187	Et	H	H	Me	4-tBu-Ph
13-188	Et	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph
13-189	Et	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph
13-190	Et	H	H	Me	3-吡啶基
13-191	Et	H	H	Me	4-吡啶基
13-192	Et	H	H	C(O)OMe	Ph
13-193	Et	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基
13-194	Et	H	H	Me	2,3-Cl ₂ -Ph
13-195	Et	H	H	H	4-Cl-Ph
13-196	Et	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基
13-197	Et	H	H	Me	2-噁唑基
13-198	Et	H	H	Me	4-Me-噁唑-2-基
13-199	Et	H	H	Me	5-Br-噁唑-2-基
13-200	Et	H	H	Me	5-Cl-噁唑-2-基
13-201	Et	H	H	Me	5-Me-噁唑-2-基
13-202	Et	H	H	Me	4,5-Me ₂ -噁唑-2-基
13-203	Et	H	H	Me	4,5-Cl ₂ -噁唑-2-基
13-204	Et	H	H	Me	4,6-Me ₂ -吡啶-2-基

[1035]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
13-205	Et	H	H	Me	2-吡嗪基
13-206	Et	H	H	Me	2-嘧啶基
13-207	Et	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基
13-208	Et	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基
13-209	Et	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基
13-210	Et	H	H	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基
13-211	Et	H	H	Me	1,3-苯并噁唑-2-基
13-212	Et	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯并噁唑-2-基
13-213	Et	H	H	Me	1,5-Me ₂ -吡唑-3-基
13-214	Et	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基
13-215	Et	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基
13-216	Et	H	H	Me	4,6-Me ₂ -嘧啶-2-基
13-217	Et	H	H	Me	3-哒嗪基
13-218	Et	H	H	Me	6-Me-哒嗪-3-基
13-219	Et	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基
13-220	Et	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基
13-221	Me	H	H	Me	5-Cl-吡啶-3-基
13-222	Me	H	H	Me	4-Br-3-Me-Ph
13-223	Me	H	H	Me	4-Cl-6-Me-吡啶-2-基
13-224	Me	H	H	Me	2-Me-吡啶-4-基
13-225	Me	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph
13-226	Me	H	H	Me	喹啉-2-基
13-227	Me	H	H	Me	异喹啉-3-基

13-228	Me	H	H	Me	5-CF ₃ -吡啶-2-基
13-229	Me	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基
13-230	Me	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基
13-231	Me	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基
13-232	Me	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基
13-233	Me	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基
13-234	Me	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph
13-235	Me	Me	H	Me	4-Cl-Ph
13-236	Me	Me	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基
13-237	Me	Me	H	Me	5-Br-吡啶-2-基
13-238	Me	Me	H	Me	5-Br-噻啶-2-基
13-239	Me	Me	H	Me	5-Cl-噻啶-2-基
13-240	Me	H	H	Me	4-NO ₂ -Ph
13-241	Me	Me	H	Me	2-吡啶基

[1036]

编号	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
13-242	Me	H	H	Me	5-烯丙基吡啶-2-基
13-243	Me	H	H	Me	5-环丙基吡啶-2-基
13-244	Me	H	H	Me	5-乙炔基吡啶-2-基
13-245	Me	H	H	Me	5-Ph-吡啶-2-基
13-246	Me	H	H	Me	3-Br-Ph
13-247	Me	H	H	Me	4-噻唑基
13-248	Me	H	H	Me	2-Cl-噻唑-4-基
13-249	Me	H	H	Me	2-Br-噻唑-4-基
13-250	Me	H	H	Me	5-OSO ₂ Me-吡啶-2-基
13-251	Me	H	H	Me	6-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基
13-252	Me	H	H	Me	6-Br-1,3-苯并噻唑-2-基
13-253	Me	H	H	Me	1,3-苯并噻唑-2-基
13-254	Me	H	H	Me	6-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基
13-255	Me	H	H	Me	6-Br-1,3-苯并噻唑-2-基
13-256	Me	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯并噻唑-2-基
13-257	Me	H	H	Me	5-NH ₂ -吡啶-2-基
13-258	Me	H	H	Me	5-OH-吡啶-2-基
13-259	Me	H	H	Me	5-OCHF ₂ -吡啶-2-基
13-260	Me	H	H	Me	5-MeO-吡啶-2-基
13-261	Me	H	H	Me	5-MeS-吡啶-2-基
13-262	Me	H	H	Me	5-NHMe-吡啶-2-基
13-263	Me	H	H	Me	5-NMe ₂ -吡啶-2-基

[1037] (B) 制剂实施例

[1038] a) 粉剂通过以下方式获得：将 10 重量份式 (I) 化合物与作为惰性物质的 90 重量份滑石混合并将该混合物在锤式打磨机中粉碎。

[1039] b) 易分散于水中的可湿性粉剂通过以下方式获得：将 25 重量份式 (I) 化合物、64 重量份含高岭土的石英作为惰性物质、10 重量份木素磺酸钾和 1 重量份油酰基甲基牛磺酸钠作为湿润剂和分散剂进行混合，并将该混合物在销钉盘磨机 (pinned-disk mill) 中研磨。

[1040] c) 易分散于水中的分散浓缩剂 (dispersion concentrate) 通过以下方式获得：将 20 重量份式 (I) 化合物与 6 重量份烷基酚聚乙二醇醚 (® Triton X 207)、3 重量份异十三烷醇聚乙二醇醚 (8E0) 和 71 重量份石蜡矿物油 (沸程例如约 255 至 277°C 以上) 进行

混合,并将该混合物在球磨机 (attrition ball mill) 中研磨至细度低于 5 微米。

[1041] d) 乳油由以下物质获得:15 重量份式 (I) 化合物、作为溶剂的 75 重量份环己酮和作为乳化剂的 10 重量份氧乙烯化壬基酚 (oxyethylated nonylphenol)。

[1042] e) 水分散性颗粒剂通过以下方式获得:

[1043] 将以下物质混合:

[1044] 75 重量份式 (I) 化合物、

[1045] 10 重量份木质素磺酸钙、

[1046] 5 重量份十二烷基硫酸钠、

[1047] 3 重量份聚乙烯醇和

[1048] 7 重量份高岭土,

[1049] 将该混合物在销钉盘磨机中研磨,并将该粉末在流化床中通过于其上喷雾作为粒化液体的水而进行粒化。

[1050] f) 水分散性颗粒剂还通过以下方式获得:

[1051] 将以下物质在胶体磨中进行均化和预粉碎:

[1052] 25 重量份式 (I) 化合物、

[1053] 5 重量份 2,2'-二萘甲烷-6,6'-二磺酸钠、

[1054] 2 重量份油酰基甲基牛磺酸钠、

[1055] 1 重量份聚乙烯醇、

[1056] 17 重量份碳酸钙和

[1057] 50 重量份水,

[1058] 随后将该混合物在砂磨机中研磨,并将所得悬浮液在喷雾塔中通过单物质喷嘴进行雾化和干燥。

[1059] (C) 生物实施例

[1060] 1. 芽前除草作用及作物植物相容性

[1061] 将单子叶或双子叶杂草或作物植物的种子置于木质纤维盆中的砂壤土中,并用泥土覆盖。然后将配制为可湿性粉剂 (WP) 形式的本发明化合物 (I) 以水性悬浮液或乳液的形式以 600 升/公顷的水施用率(经换算)施用至土壤覆盖层的表面,其中添加 0.2% 的润湿剂。

[1062] 在处理,将盆置于温室中,并使之保持处于对于供试植物而言良好的生长条件下。大约 3 周之后,通过与未处理的对照组比较,对制剂的活性进行目测评价(以百分比(%)计的除草活性:100%活性=植物死亡,0%活性=类似于对照植物)。

[1063] 本发明的化合物 (I) 在每公顷 0.32kg 或更少活性物质的施用率下对许多有害植物具有良好的芽前除草活性。例如,化合物编号 1-28、1-154、2-2、2-16、2-28、2-116、2-120、2-132、2-117、1-116、1-119、1-210、1-214、1-236、2-47、2-64、2-65、2-124、2-135、2-148、2-155、2-215、2-217、2-224、2-241、2-240、2-243、2-249、3-4、3-25、3-26、3-112、3-121、3-135、3-36、3-161、3-176、3-353 及表 1 至 12 中的其它化合物以每公顷 0.32kg 活性物质的施用率通过芽前法施用时对有害植物,例如大穗看麦娘 (*Alopecurus myosuroides*)、稗草 (*Echinochloa crus galli*)、狗尾草 (*Setaria viridis*) 及阿拉伯婆婆纳 (*Veronica persica*),具有良好的除草活性。

[1064] 同时,用芽前法施用时,本发明的化合物即使在高活性化合物剂量下也不损害双子叶作物例如油菜,此外,其不伤害禾本科作物例如小麦及水稻。本发明的一些化合物具有较高的选择性,其因此适于通过芽前法防治农业作物中不想要的植物。

[1065] 2. 芽后除草作用及作物植物相容性

[1066] 将单子叶和双子叶杂草及作物植物的种子置于木质纤维盆中的砂壤土中,用泥土覆盖,并使之于温室中良好生长条件下栽培。播种 2 至 3 周后,在一叶期处理所述供试植物。然后,将配制为可湿性粉剂(WP)形式的本发明化合物(I)以水悬液或乳液的形式以 600 升/公顷的水施用率(经换算)喷雾到植物绿色部位上,其中添加 0.2%的润湿剂。将所述供试植物于温室中最佳生长条件下保持约 3 周,然后通过与未处理对照组进行比较而对所述制剂的作用进行目测评价(以百分比(%)计的除草活性:100%活性=植物死亡,0%活性=类似于对照植物)。

[1067] 从结果可以明显看出,本发明化合物(I)在每公顷 0.32kg 或更少活性物质的施用率下对较宽范围的禾本科杂草及阔叶杂草具有良好的芽后除草活性。例如,化合物编号 1-28、1-154、2-2、2-16、2-28、2-116、2-120、2-132、2-117、1-116、1-119、1-210、1-214、1-236、2-47、2-64、2-65、2-124、2-135、2-148、2-155、2-215、2-217、2-224、2-241、2-240、2-243、2-249、3-4、3-25、3-26、3-112、3-121、3-161、3-135、3-136、3-176、3-353 及表 1 至 12 中的其它化合物,以每公顷 0.32kg 或更少活性物质的施用率通过苗后法施用时对有害植物,例如野燕麦(*Avena fatua*)、稗草、多花黑麦草(*Lolium multiflorum*)、狗尾草、阿拉伯婆婆纳、三色堇(*Viola tricolor*)及大穗看麦娘,具有良好的除草活性。