



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 101374820 B

(45) 授权公告日 2013. 09. 04

(21) 申请号 200680052935. 8

(22) 申请日 2006. 12. 29

(30) 优先权数据

06000013. 0 2006. 01. 02 EP

(85) PCT申请进入国家阶段日

2008. 08. 18

(86) PCT申请的申请数据

PCT/EP2006/070271 2006. 12. 29

(87) PCT申请的公布数据

W02007/077201 DE 2007. 07. 12

(73) 专利权人 巴斯夫欧洲公司

地址 德国路德维希港

(72) 发明人 E·胡佩 C·扎加尔 M·维切尔

T·库恩 W·K·莫贝格

L·帕拉拉帕多 F·施特尔策

A·韦思科维 M·普尔

R·赖因哈德 B·西韦尼奇

K·格罗斯曼 T·埃尔哈德特

M·拉克

(74) 专利代理机构 北京市中咨律师事务所

11247

代理人 刘金辉 林柏楠

(51) Int. Cl.

C07D 241/08 (2006. 01)

C07D 401/06 (2006. 01)

C07D 403/06 (2006. 01)

C07D 409/06 (2006. 01)

C07D 409/12 (2006. 01)

C07D 413/06 (2006. 01)

C07D 417/06 (2006. 01)

C07D 417/12 (2006. 01)

C07F 5/02 (2006. 01)

C07F 7/10 (2006. 01)

C07F 7/18 (2006. 01)

C07F 9/6509 (2006. 01)

C07K 5/065 (2006. 01)

A01N 37/46 (2006. 01)

(56) 对比文件

Russell R. King et al. Herbicidal Properties of the Thaxtomin Group of Phytotoxins. 《J. Agric. Food Chem. 》. 2001, 第 49 卷第 2298-2301.

审查员 何小平

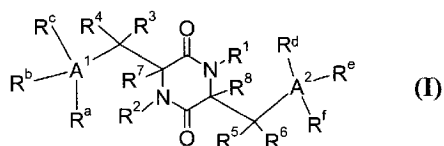
权利要求书4页 说明书218页

(54) 发明名称

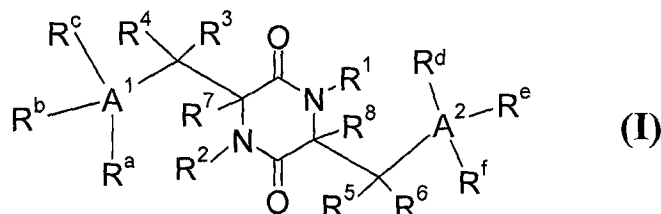
具有除草作用的嘧啶化合物

(57) 摘要

本发明涉及式 (I) 的嘧啶化合物或式 (I) 的嘧啶化合物的可农用盐作为除草剂的用途, 其中式 (I) 中的变量如权利要求和说明书所定义。



1. 式 I 的哌嗪化合物或式 I 的哌嗪化合物的可农用盐作为除草剂的用途；



其中在式 I 中各变量如下所定义:

 R^1 和 R^2 相互独立地为:

C₁-C₆ 烷基；

其中 R¹ 和 R² 可以部分或完全被卤代和 / 或可以带有 1-3 个下列基团 : 氰基、羟基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、二 -C₁-C₄ 烷基氨基、C₁-C₄ 烷基羰基、羟基羰基、C₁-C₄ 烷氧羰基、氨基羰基、C₁-C₄ 烷基氨基羰基、二 -C₁-C₄ 烷基氨基羰基或 C₁-C₄ 烷基羰氧基 ;

并且其中 R^1 可以额外为氢：

R^3 为基团 R^{26} 或 OR^{27} , 其中

R^{26} 和 R^{27} 相互独立地为氢、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 烷基羰基、苯基- C_1 - C_6 烷基或苯基羰基，其中取代基的上述脂族或芳族结构部分可部分或全部被卤代；或为基团 SO_2R^{31} ，其中 R^{31} 为 C_1 - C_6 烷基或苯基，其中 R^{31} 中的苯基取代基可部分或全部被卤代和 / 或可带有 1-3 个 C_1 - C_6 烷基；

R^4 、 R^5 、 R^6 为氢：

R^7 、 R^8 相互独立地为氢或甲基；

A¹ 为苯基或吡啶基, 且 A² 为苯基, 其中 R^a 在 A¹ 的连接点的邻位与 A¹ 的碳原子或氮原子连接且其中 R^a 具有如下含义之一:

R^a 选自卤素、氰基、硝基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 链炔基、Z¹P(0)(OR⁹)₂、Z³COR¹¹、Z⁴NR¹²R¹³、Z⁵CH=N-OR¹⁴、Z⁶OR¹⁵、Z⁷SO₂R¹⁶、C₁-C₆ 烷硫基和 C₁-C₆ 烷基亚磺酰基, 其中,

Z¹ 为键或 CH₂, 且 R⁹ 和 R¹⁰ 各自为氢或 C₁-C₆ 烷基;

Z^3 为键且 R^{11} 为氢、 C_1-C_6 烷基、羟基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_3-C_6 链烯基氧基、 C_3-C_6 链炔基氧基、氨基、 C_1-C_6 烷基氨基、[二 (C_1-C_6) 烷基] 氨基、 C_1-C_6 烷氧基氨基、 $N-C_1-C_6$ 烷氧基 $-N-C_1-C_6$ 烷基氨基、 C_1-C_6 烷基磺酰氨基、 C_1-C_6 烷基氨基磺酰氨基、[二 (C_1-C_6) 烷基氨基] 磺酰氨基、苯基、苯氧基、苯基氨基或萘基 ; 或

Z^4 为键或 CH_2 且 R^{12} 和 R^{13} 相互独立地为氢、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 环烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 链炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基羰基、[二 ($\text{C}_1\text{-C}_6$) 烷基氨基] 羰基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷氧羰基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基磺酰基、苯基羰基或苯基磺酰基 ; 或

Z^5 为键或 CH_2 , 且 R^{14} 为氢或 C_1-C_6 烷基; 或

Z^6 为键或 CH_2 且 R^{15} 为氢、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 环烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 链烯基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 链炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基羰基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷氧羰基、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基、苯基或苯基- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基；或

Z^7 为键且 R^{16} 为 C_1-C_6 烷基或苯基；

以及其中 R^b、R^c、R^d、R^e 和 R^f 相互独立地为氢,具有对 R^a 提及的含义之一且可额外为: C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 环烷基、[三 (C₁-C₆) 烷基甲硅烷基]-(C₉-C₆) 链炔基;

其中取代基 R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 的上述脂族、环状或芳族结构部分可部分或全部被卤代。

2. 根据权利要求 1 的式 I 的哌嗪化合物的用途, 其中 R^2 为 C_1 - C_6 烷基。

3. 根据权利要求 1 的式 I 的哌嗪化合物的用途, 其中 R^3 为氢。

4. 根据权利要求 2 的式 I 的哌嗪化合物的用途, 其中 R^3 为氢。

5. 根据权利要求 1-4 中任一项的式 I 的哌嗪化合物的用途, 其中 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 为氢。

6. 根据权利要求 1-4 中任一项的式 I 的哌嗪化合物的用途, 其中哌嗪环中的两个手性中心具有 (S, S) 构型。

7. 根据权利要求 5 的式 I 的哌嗪化合物的用途, 其中哌嗪环中的两个手性中心具有 (S, S) 构型。

8. 一种包含除草有效量的至少一种根据权利要求 1-7 中任一项的式 I 的哌嗪化合物或 I 的可农用盐和常用于配制作物保护试剂的助剂的组合物。

9. 一种制备根据权利要求 8 的组合物方法, 其包括将除草有效量的至少一种根据权利要求 1-7 中任一项的式 I 的哌嗪化合物或 I 的可农用盐和常用于配制作物保护试剂的助剂混合。

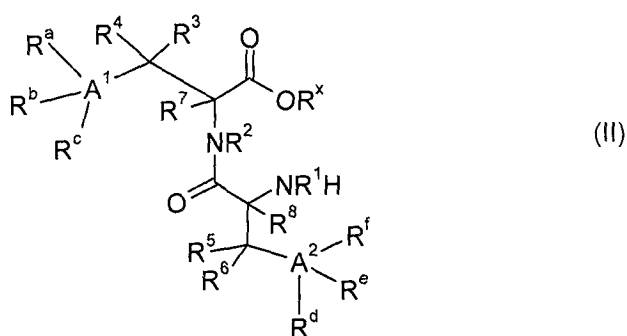
10. 一种防治不希望的植物生长的方法, 其包括使除草有效量的至少一种根据权利要求 1-7 中任一项的式 I 的哌嗪化合物或 I 的可农用盐作用于植物、其种子和 / 或其生长地。

11. 根据权利要求 1-7 中任一项的通式 I 的哌嗪化合物,

- 但其中 A^1 和 A^2 为苯基, R^1 为甲基, R^2 为氢或甲基, R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 为氢, 取代基 R^a 和 R^b 各自为位于苯环 A^1 的两个邻位的羟基, 且 R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 为氢的式 I 化合物除外,

- 此外, 其中 A^1 为苯基, R^a 为氯, R^b 和 R^c 为氢, 基团 A^2 ($R^dR^eR^f$) 为邻氯苯基, R^1 和 R^2 为甲基羰基和 R^3 - R^8 各自为氢的式 I 化合物除外。

12. 一种制备根据权利要求 11 的式 I 的哌嗪化合物的方法, 其包括使式 II 的二肽在酸或碱存在下或在升高温度下反应:



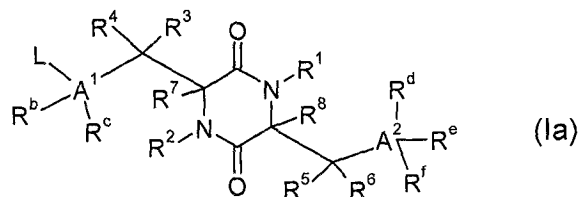
其中变量 A^1 、 A^2 、 R^1 - R^8 、 R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 如权利要求 1 中对式 I 所定义且其中 OR^x 为经由氧原子连接的离去基团。

13. 一种制备根据权利要求 11 的式 I 的哌嗪化合物的方法, 其中 $R^1 \neq$ 氢, 该方法包括使其中 R^1 为氢的式 I 的哌嗪化合物与含有不同于氢的基团 R^1 的烷基化剂或酰化剂反应。

14. 一种制备根据权利要求 11 的式 I 的哌嗪化合物的方法, 其中 $R^2 \neq$ 氢, 该方法包括使其中 R^2 为氢的式 I 的哌嗪化合物与含有不同于氢的基团 R^2 的烷基化剂或酰化剂反应。

15. 一种制备根据权利要求 11 的式 I 的哌嗪化合物的方法, 其包括使式 Ia 的哌嗪化合

物在催化剂和碱存在下与含有 R^a 的偶联剂反应：

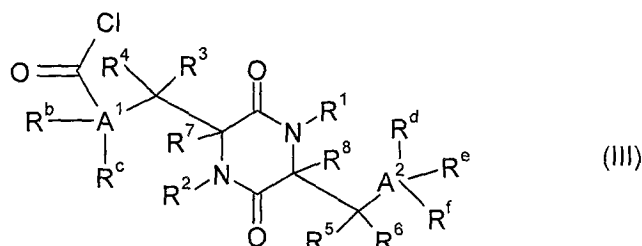


其中 L 为卤素或 $S(O)_n R^k$, 其中 $n = 0, 1, 2$ 且 R^k 为 C_1-C_6 烷基、卤代- (C_1-C_6) 烷基或任选卤代或 C_1-C_4 烷基取代的芳基且其中其它变量 A^1 、 A^2 、 R^1-R^8 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 如权利要求 1 中对式 I 所定义。

16. 一种制备根据权利要求 11 的式 I 的嘧啶化合物的方法, 其中 R^a 为 $COOH$, 其包括使其中 R_a 为 $COOCH_3$ 的式 I 的嘧啶化合物与 Me_3SnOH 反应。

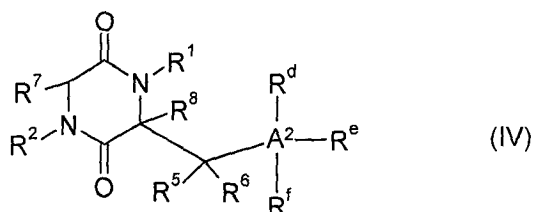
17. 一种制备根据权利要求 11 的式 I 的嘧啶化合物的方法, 其中 R^a 为基团 $CONR^u R^v$ 或 $COOR^w$, 其中 R^u 和 R^v 相互独立地为氢、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 链炔基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、 C_1-C_6 烷基氨基磺酰基、[二- (C_1-C_6) 烷基氨基]磺酰基或苯基且 R^w 为 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基或 C_2-C_6 链炔基,

该方法包括用氯化试剂将其中 R^a 为 $COOH$ 的式 I 的嘧啶化合物转化为式 III 的酰氯：

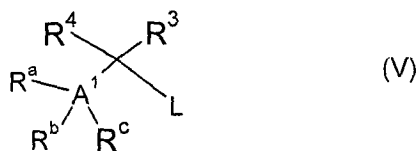


其中变量 A^1 、 A^2 、 R^1-R^8 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 如权利要求 1 中对式 I 所定义, 然后使 III 与胺 $HNR^u R^v$ 或醇 HOR^w 反应。

18. 一种制备根据权利要求 11 的式 I 的嘧啶化合物的方法, 其包括使式 IV 的嘧啶化合物：

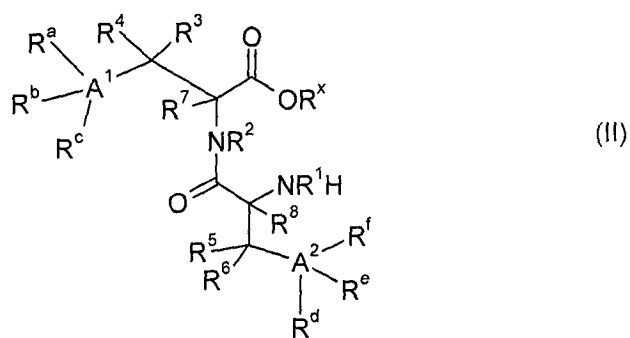


其中 A^2 、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^d 、 R^e 和 R^f 如权利要求 1 中对式 I 所定义, 在碱存在下与式 V 化合物反应：



其中 A^1 、 R^3 、 R^4 、 R^a 、 R^b 和 R^c 如权利要求 1 中对式 I 所定义且其中 L 为离去基团。

19. 式 II 的二肽：

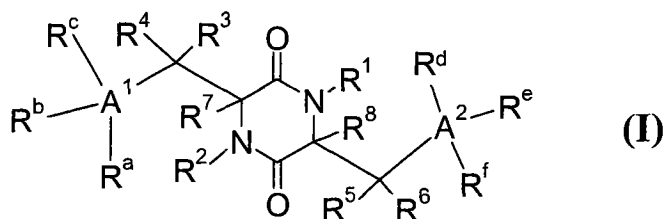


其中变量 A¹、A²、R¹-R⁸、R^a、R^b、R^c、R^d、R^e 和 R^f 如权利要求 1 中对式 I 所定义且其中 OR^x 为经由氧原子连接的离去基团。

具有除草作用的嘧啶化合物

[0001] 本发明涉及式 I 的嘧啶化合物或式 I 的嘧啶化合物的可农用盐作为除草剂的用途；

[0002]



[0003] 其中在式 I 中各变量如下所定义：

[0004] R^1 和 R^2 相互独立地为：

[0005] 氰基、C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 链烯基、C₃-C₆ 环烯基、C₃-C₆ 链炔基、C₃-C₆ 环炔基、苯基、苯基 -C₁-C₆ 烷基、杂环基、杂环基 -C₁-C₆ 烷基、苯基 -C₁-C₆ 烷氧羰基 -C₁-C₆ 烷基或苯基杂环基 -C₁-C₆ 烷基 ;或 COR²¹, 其中

[0006] R^{21} 为氢、 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_3-C_6 环烯基、 C_2-C_6 链炔基、 C_3-C_6 环炔基、羟基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_3-C_6 链烯氧基、 C_3-C_6 链炔氧基、氨基、 C_1-C_6 烷基氨基、二- C_1-C_6 烷基氨基、 C_3-C_6 链烯基氨基、 C_3-C_6 链炔基氨基、 C_1-C_6 烷基磺酰基氨基、N-(C_2-C_6 链烯基)-N-(C_1-C_6 烷基) 氨基、N-(C_2-C_6 链炔基)-N-(C_1-C_6 烷基) 氨基、N-(C_1-C_6 烷氧基)-N-(C_1-C_6 烷基) 氨基、N-(C_2-C_6 链烯基)-N-(C_1-C_6 烷氧基) 氨基、N-(C_2-C_6 链炔基)-N-(C_1-C_6 烷氧基) 氨基、苯基、苯基氨基、苯氧基、萘基或杂环基；或

[0007] $\text{NR}^{22}\text{R}^{23}$, 其中

[0008] R^{22} 和 R^{23} 相互独立地为氢、 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 链烯基、 C_3-C_6 环烯基、 C_3-C_6 链炔基、 C_3-C_6 环炔基或 C_1-C_6 烷基羰基；或 OR^{24} ，其中

[0009] R^{24} 为 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 链烯基、 C_3-C_6 环烯基、 C_3-C_6 链炔基、 C_3-C_6 环炔基、苯基或苯基- C_1-C_6 烷基；或

[0010] SO_2R^{25} , 其中 R^{25} 为 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基或苯基;

[0011] 其中 R^1 和 R^2 的取代基的上述脂族、环状或芳族结构部分可以部分或完全被卤代和/或可以带有 1-3 个下列基团: 氰基、羟基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 卤代烷基、 C_3 - C_6 环烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、二- C_1 - C_4 烷基氨基、 C_1 - C_4 烷基羰基、羟基羰基、 C_1 - C_4 烷氧羰基、氨基羰基、 C_1 - C_4 烷基氨基羰基、二- C_1 - C_4 烷基氨基羰基或 C_1 - C_4 烷基羰氧基;

[0012] 并且其中 R^1 可以额外为氢；

[0013] R^3 为基团 R^{26} 、 OR^{27} 、 SR^{28} 、 $NR^{29}R^{30}$ 或 $N(OR^{31})R^{32}$, 其中

[0014] R^{26} 、 R^{27} 、 R^{28} 、 R^{29} 和 R^{32} 相互独立地为氢、 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 链烯基、 C_3-C_6 链炔基、 C_3-C_6 卤代链炔基、甲酰基、 C_1-C_6 烷基羰基、 C_3-C_6 环烷基羰基、 C_2-C_6 链烯基羰基、 C_2-C_6 链炔基羰基、 C_1-C_6 烷氧基-(C_1-C_6) 烷基、 C_1-C_6 烷氧羰基、 C_2-C_6 链烯基氧基羰基、 C_3-C_6 链炔基氧基羰基、 C_1-C_6 烷基氨基羰基、 C_3-C_6 链烯基氨基羰基、 C_3-C_6 链炔基氨基羰基、 C_1-C_6 烷基磺酰氨基羰基、 C_1-C_6 烷基氨基羰基、[二 (C_1-C_6) 烷基氨基] 羰基、N-(C_3-C_6 链烯

基)-N-(C₁-C₆ 烷基)-氨基羰基、N-(C₃-C₆ 链炔基)-N-(C₁-C₆ 烷基)-氨基羰基、N-(C₁-C₆ 烷氧基)-N-(C₁-C₆ 烷基)-氨基-羰基、N-(C₃-C₆ 链烯基)-N-(C₁-C₆ 烷氧基)-氨基羰基、N-(C₃-C₆ 链炔基)-N-(C₁-C₆ 烷氧基)-氨基羰基、二(C₁-C₆ 烷基)-氨基硫代羰基、C₁-C₆ 烷基羰基-C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基亚氨基-C₁-C₆ 烷基、N-(C₁-C₆ 烷基氨基)亚氨基-C₁-C₆ 烷基、N-(二 C₁-C₆ 烷基氨基)亚氨基-C₁-C₆ 烷基或[三(C₁-C₄) 烷基]甲硅烷基,其中上述取代基的脂族或碳环结构部分可部分或全部被卤代和/或可带有1-3个如下基团:氰基、羟基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、[二(C₁-C₄) 烷基]氨基、C₁-C₄ 烷基羰基、羟基羰基、C₁-C₄ 烷氧羰基、氨基羰基、C₁-C₄ 烷基氨基羰基、[二(C₁-C₄) 烷基]氨基羰基或C₁-C₄ 烷基羰氧基;或苯基、苯基-C₁-C₆ 烷基、苯基羰基、苯基羰基-C₁-C₆ 烷基、苯氧基羰基、苯基氨基羰基、苯基磺酰氨基羰基、N-(C₁-C₆ 烷基)-N-(苯基)氨基羰基、苯基-C₁-C₆ 烷基羰基、杂环基、杂环基-C₁-C₆ 烷基、杂环基羰基、杂环基羰基-C₁-C₆ 烷基、杂环基氧基羰基、杂环基氨基羰基、杂环基磺酰氨基羰基、N-(C₁-C₆ 烷基)-N-(杂环基)氨基羰基或杂环基-C₁-C₆ 烷基羰基,其中取代基的苯基或杂环基结构部分可部分或全部被卤代和/或可带有1-3个如下基团:硝基、氰基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基或C₁-C₄ 卤代烷氧基;或

[0015] S(O)_nR³³, 其中

[0016] n 为 1 或 2; 和

[0017] R³³ 为 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 卤代烷基或苯基, 以及其中苯基取代基可部分或全部被卤代和/或可带有1-3个如下基团:硝基、氰基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基或C₁-C₄ 卤代烷氧基; 和

[0018] R³⁰ 和 R³¹ 相互独立地为氢、C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 链炔基, 其中取代基的脂族或碳环结构部分可部分或全部被卤代和/或可带有1-3个如下基团:氰基、羟基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、[二(C₁-C₄) 烷基]氨基、C₁-C₄ 烷基羰基、羟基羰基、C₁-C₄ 烷氧羰基、氨基羰基、C₁-C₄ 烷基氨基羰基、[二(C₁-C₄) 烷基]氨基羰基或C₁-C₄ 烷基羰氧基,

[0019] 苯基、苯基-C₁-C₆ 烷基、杂环基或杂环基-C₁-C₆ 烷基, 其中取代基的苯基或杂环基结构部分可部分或全部被卤代和/或可带有1-3个如下基团:硝基、氰基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₁-C₄ 烷氧基或C₁-C₄ 卤代烷氧基;

[0020] R⁴、R⁵、R⁶ 相互独立地为氢、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 烷氧基,

[0021] 其中上述取代基 R⁴、R⁵ 或 R⁶ 的脂族结构部分可部分或全部被卤代和/或可带有1-3个如下基团:氰基、羟基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、[二(C₁-C₄) 烷基]氨基、C₁-C₄ 烷基羰基、羟基羰基、C₁-C₄ 烷氧羰基、氨基羰基、C₁-C₄ 烷基氨基羰基、[二(C₁-C₄) 烷基]氨基羰基或C₁-C₄ 烷基羰氧基;

[0022] R³ 和 R⁴ 还可一起为酮基;

[0023] R⁷、R⁸ 相互独立地为氢、羟基、C₁-C₆ 烷基, 该 C₁-C₆ 烷基可部分或全部被卤代和/或带有1-3个如下基团:氰基、羟基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、[二(C₁-C₄) 烷基]氨基、C₁-C₄ 烷基羰基、羟基羰基、C₁-C₄ 烷氧羰基、氨基羰基、C₁-C₄ 烷基氨基羰基、[二(C₁-C₄) 烷基]氨基羰基或C₁-C₄ 烷基羰氧基;

[0024] A¹、A² 相互独立地为芳基或杂芳基, 但吡啶基除外, 其中 R^a 在 A¹ 的连接点的邻位与

A¹ 的碳原子或氮原子连接且其中 R^a 具有如下含义之一：

[0025] R^a 为卤素、氰基、硝基、C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₃-C₆ 环烯基、C₄-C₁₀ 链二烯基、C₂-C₆ 链炔基、[三 (C₁-C₆) 烷基甲硅烷基]-(C₂-C₆) 链炔基、C₃-C₆ 环炔基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 烷基亚磺酰基、芳基、苯基-(C₁-C₆) 烷基、苯基-(C₂-C₆) 链烯基、苯基磺酰基-(C₁-C₆) 烷基、杂环基、杂环基-(C₁-C₆) 烷基或苯基-[C₁-C₆ 烷氧羰基]-(C₁-C₆) 烷基、

[0026] Z¹P(O)(OR⁹)₂、Z²B(OR¹⁰)₂, 其中

[0027] R⁹ 和 R¹⁰ 各自为氢或 C₁-C₆ 烷基且 Z²B(OR¹⁰)₂ 中的基团 R¹⁰ 可一起形成 C₂-C₄ 亚烷基链；或

[0028] Z³COR¹¹, 其中

[0029] R¹¹ 为氢、C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₃-C₆ 环烯基、C₂-C₆ 链炔基、C₃-C₆ 环炔基、羟基、C₁-C₆ 烷氧基、C₃-C₆ 链烯基氧基、C₃-C₆ 链炔基氧基、氨基、C₁-C₆ 烷基氨基、[二 (C₁-C₆) 烷基] 氨基、C₁-C₆ 烷氧基氨基、[二 (C₁-C₆) 烷氧基] 氨基、C₁-C₆ 烷基磺酰氨基、C₁-C₆ 烷基氨基磺酰氨基、[二 (C₁-C₆) 烷基氨基] 磺酰氨基、C₃-C₆ 链烯基氨基、C₃-C₆ 链炔基氨基、N-(C₂-C₆ 链烯基)-N-(C₁-C₆ 烷基) 氨基、N-(C₂-C₆ 链炔基)-N-(C₁-C₆ 烷基) 氨基、N-(C₁-C₆ 烷氧基)-N-(C₁-C₆ 烷基) 氨基、N-(C₂-C₆ 链烯基)-N-(C₁-C₆ 烷氧基) 氨基、N-(C₂-C₆ 链炔基)-N-(C₁-C₆ 烷氧基) 氨基、苯基、苯氧基、苯基氨基、萘基或杂环基；或

[0030] Z⁴NR¹²R¹³, 其中

[0031] R¹² 和 R¹³ 相互独立地为氢、C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 链烯基、C₃-C₆ 环烯基、C₃-C₆ 链炔基、C₃-C₆ 环炔基、C₁-C₆ 烷基羰基、C₃-C₆ 环烷基羰基、[二 (C₁-C₆) 烷基氨基] 羰基、C₁-C₆ 烷氧羰基、C₁-C₆ 烷氧羰基-(C₁-C₆) 烷基、C₁-C₆ 烷基磺酰基、C₁-C₆ 烷基氨基磺酰基、[二 (C₁-C₆) 烷基氨基] 磺酰基、苯基羰基、苯基氨基羰基、苯基磺酰基、苯基磺酰氨基羰基或杂环基羰基；或

[0032] Z⁵CH=N-O-R¹⁴, 其中 R¹⁴ 为氢或 C₁-C₆ 烷基；或

[0033] Z⁶OR¹⁵, 其中

[0034] R¹⁵ 为氢、C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₃-C₆ 链烯基、C₃-C₆ 环烯基、C₃-C₆ 链炔基、C₃-C₆ 环炔基、C₁-C₆ 烷基羰基、C₁-C₆ 烷氧羰基-(C₁-C₆) 烷基、[二 (C₁-C₆) 烷氧羰基]-(C₁-C₆) 烷基、苯基或苯基-(C₁-C₆) 烷基；

[0035] 或

[0036] Z⁷SO₂R¹⁶, 其中 R¹⁶ 为 C₁-C₆ 烷基或苯基；和其中

[0037] Z¹、Z²、Z³、Z⁴、Z⁵、Z⁶、Z⁷ 相互独立地为键、-CH₂-、-CH₂-CH₂-、-O-CH(R¹⁷)-、-S-CH(R¹⁸)-、-S(O)-CH(R¹⁹)- 或 -SO₂CH(R²⁰)-, 和其中 R¹⁷、R¹⁸、R¹⁹ 和 R²⁰ 相互独立地为氢或 C₁-C₆ 烷基；和

[0038] 其中上述取代基 R^a 的脂族、环状或芳族结构部分可部分或全部被卤代和 / 或可带有 1-3 个如下基团：氰基、羟基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、[二 (C₁-C₄) 烷基] 氨基、C₁-C₄ 烷基羰基、羟基羰基、C₁-C₄ 烷氧羰基、氨基羰基、C₁-C₄ 烷基氨基羰基、[二 (C₁-C₄) 烷基] 氨基羰基或 C₁-C₄ 烷基羰氧基；和

[0039] R^b、R^c、R^d、R^e 和 R^f 各自相互独立地为氢或具有对 R^a 给出的含义之一，和

[0040] 其中与 A¹ 的相邻环原子连接的两个基团 R^a、R^b 或 R^c 或与 A² 的相邻环原子连接的两个基团 R^d、R^e 或 R^f 也可作为直链 C₃-C₆ 亚烷基，其可部分或全部被卤代且其可带有 1-3 个如下基团：氰基、羟基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 卤代烷基、C₃-C₆ 环烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、

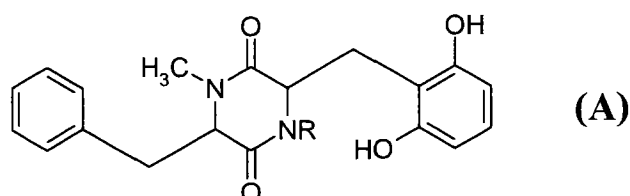
[二(C₁-C₄)烷基]氨基、C₁-C₄烷基羰基、羟基羰基、C₁-C₄烷氧羰基、氨基羰基、C₁-C₄烷基氨基羰基、[二(C₁-C₄)烷基]氨基羰基或C₁-C₄烷基羰氧基,其中C₃-C₆亚烷基中的一个CH₂基团可被羰基、硫代羰基或磺酰基替换,以及其中C₃-C₆亚烷基中的一个或两个非相邻CH₂基团在每种情况下可被氧、硫或基团NR³⁴替换,其中R³⁴具有对R¹²所给的含义之一。

[0041] 由植物病原体疮痂链霉菌(*S. scabies*)所产生的Thaxtomin A和B(King R. R. 等, *J. Agric. Food Chem.* (1992) 40, 834-837)是具有中心哌嗪-2,5-二酮环的天然产物,该环在3位带有4-硝基吡啶-3-基甲基且在2位带有任选OH取代的苄基。由于它们的植物损害作用,也研究了这些化合物作为除草剂的可能应用(King R. R. 等, *J. Agric. Food Chem.* (2001) 49, 2298-2301)。

[0042] EP-A 181152 和 EP-A 243122 描述了结构类似的哌嗪化合物及其作为血小板活化因子(platelet activating factor)的拮抗剂的用途。

[0043] US 2003/0171379A1 描述了mactanamide,即式A的杀真菌二酮基哌嗪在药物中作为消炎化合物的用途:

[0044]



[0045] 其中R为H或甲基。

[0046] WO 99/48889、WO 01/53290 和 WO 2005/011699 描述了在3-或6-位具有经由亚甲基或次甲基连接的4-咪唑基且在其它3-或6-位具有苄基的2,5-二酮基哌嗪化合物。这些化合物为抗肿瘤化合物。

[0047] 化合物1,4-二乙酰基-3,6-二(2-氯苯基)哌嗪-2,5-二酮是已知的(L. X. Wang, Y. Z. Shi, Z. M. Du, H. W. Hu, *Chinese Chem. Lett.* (1993) 4, 687-688)。

[0048] 本发明的目的是提供具有除草作用的化合物。具体而言,意欲提供尤其甚至在低施用率下具有高除草活性且其与作物植株的相容性足够用于商业应用的化合物。

[0049] 这一和其它目的由开头所定义的式I化合物及其可农用盐实现。

[0050] 因此,本发明涉及通式I的哌嗪化合物或式I的哌嗪化合物的可农用盐作为除草剂的用途,即防治有害植物的用途。

[0051] 本发明还涉及包含除草有效量的至少一种式I的哌嗪化合物或I的可农用盐和常用于配作物保护试剂的助剂的组合物。

[0052] 此外,本发明还涉及一种防治不希望的植物生长的方法,包括使除草有效量的至少一种式I的哌嗪化合物或I的可农用盐作用于植物、其种子和/或其生长地。

[0053] 式I的哌嗪化合物是新的且也形成本发明主题的一部分,

[0054] - 但其中A¹和A²为苯基,R¹为甲基,R²为氢或甲基,R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸为氢,取代基R^a和R^b各自为位于苯环A¹的两个邻位的羟基,且R^c、R^d、R^e和R^f为氢的式I化合物除外,

[0055] - 此外,其中A¹为苯基和A²为4-咪唑基或A¹为4-咪唑基和A²为苯基的式I化合物除外,和

[0056] - 此外,其中A¹为苯基,R^a为氯,R^b和R^c为氢,基团A²(R^dR^eR^f)为邻氯苯基,R¹和R²

为甲基羰基和 R^3-R^8 各自为氢的式 I 化合物除外。

[0057] 此外,本发明还涉及制备式 I 化合物的方法和中间体。

[0058] 本发明的其它实施方案由权利要求书、说明书和实施例显而易见。应理解的是本发明主题的上述以及下面要说明的特征不仅可以在各种特定情形下给出的组合应用,而且还可以其它不偏离本发明范围的组合应用。

[0059] 取决于取代方式,式 I 化合物可以包含一个或多个手性中心,此时它们以对映体或非对映体混合物存在。本发明提供了纯对映体或非对映体及其混合物二者。

[0060] 式 I 化合物还可以以其可农用盐形式存在,该盐的性质通常并不重要。合适的盐通常是对化合物 I 的除草作用没有不利影响的那些阳离子的盐或其阳离子和阴离子分别对化合物 I 的除草作用没有不利影响的那些酸的酸加成盐。

[0061] 合适的阳离子尤其是碱金属的离子,优选锂、钠和钾离子,碱土金属的离子,优选钙和镁离子,以及过渡金属离子,优选锰、铜、锌和铁离子以及铵离子,其中需要的话 1-4 个氢原子可以被 C_1-C_4 烷基、羟基 $-C_1-C_4$ 烷基、 C_1-C_4 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷基、羟基 $-C_1-C_4$ 烷氧基 $-C_1-C_4$ 烷基、苯基或苄基替换,优选铵、二甲基铵、二异丙基铵、四甲基铵、四丁基铵、2-(2-羟基乙-1-氧基)乙-1-基铵、二(2-羟基乙-1-基)铵、三甲基苄基铵,还有磷离子,铈离子,优选三(C_1-C_4 烷基)铈,以及氧化铈离子,优选三(C_1-C_4 烷基)氧化铈。

[0062] 有用酸加成盐的阴离子主要是氯离子、溴离子、氟离子、硫酸氢根、硫酸根、磷酸二氢根、磷酸氢根、硝酸根、碳酸氢根、碳酸根、六氟硅酸根、六氟磷酸根、苯甲酸根,以及 C_1-C_4 链烷酸的阴离子,优选甲酸根、乙酸根、丙酸根和丁酸根。

[0063] 对本发明化合物的取代基所提到的有机结构部分是具体基团成员的单独列举的集合性术语。所有烃链,如烷基、卤代烷基以及在氰基烷基、烷氧基、卤代烷氧基、烷硫基、卤代烷硫基、烷基亚磺酰基、卤代烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、卤代烷基磺酰基、N-烷基氨基磺酰基、N,N-二烷基氨基磺酰基、二烷基氨基、N-烷基磺酰基氨基、N-卤代烷基磺酰基氨基、N-烷基-N-烷基磺酰基氨基、N-烷基-N-卤代烷基磺酰基氨基、烷基羰基、卤代烷基羰基、烷氧羰基、卤代烷氧羰基、烷基羰氧基、烷基氨基羰基、二烷基氨基羰基、二烷基氨基硫羰基、烷氧基烷基、二烷氧基烷基、烷硫基烷基、二烷基氨基烷基、二烷基肼基烷基、烷基亚氨基氧烷基、烷基羰基烷基、烷氧亚氨基烷基、N-(烷基氨基)亚氨基烷基、N-(二烷基氨基)亚氨基烷基、烷氧羰基烷基、二烷基氨基羰基烷基、苯基链烯基羰基、杂环基链烯基羰基、N-烷氧基-N-烷基氨基羰基、N-烷基-N-苯基氨基羰基、N-烷基-N-杂环基氨基羰基、苯基烷基、杂环基烷基、苯基羰基烷基、杂环基羰基烷基、二烷基氨基烷氧羰基、烷氧基烷氧羰基、链烯基羰基、链烯氧基羰基、链烯基氨基羰基、N-链烯基-N-烷基氨基羰基、N-链烯基-N-烷氧基氨基羰基、链炔基羰基、炔氧羰基、链炔基氨基羰基、N-链炔基-N-烷基氨基羰基、N-链炔基-N-烷氧基氨基羰基、链烯基、链炔基、卤代链烯基、卤代链炔基和烷氧基烷氧基结构部分中的烷基结构部分可以是直链或支化的。前缀 C_n-C_m 表示烃结构部分的相应碳数。除非另有指明,卤代取代基优选带有 1-5 个相同或不同的卤原子,尤其是氟原子或氯原子。

[0064] 术语卤素在每种情况下表示氟、氯、溴或碘。

[0065] 其它含义的实例是:

[0066] 烷基以及例如在烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基和烷基磺酰基、烷基羰基、烷基氨

基、烷基甲硅烷基、苯基烷基、苯基磺酰基烷基、杂环基烷基中的烷基结构部分：具有 1 个或多个碳原子，例如 1-2、1-4 或 1-6 个碳原子的饱和直链或支化烃基，例如 C_1 - C_6 烷基，如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基、1-乙基-2-甲基丙基。在本发明的一个实施方案中，烷基表示小烷基如 C_1 - C_4 烷基。在本发明的另一实施方案中，烷基表示较大烷基如 C_5 - C_6 烷基。

[0067] 卤代烷基：其氢原子部分或完全被卤原子如氟、氯、溴和 / 或碘取代的上述烷基，例如氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯一氟甲基、一氯二氟甲基、2-氟乙基、2-氯乙基、2-溴乙基、2-碘乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基、2-氟丙基、3-氟丙基、2,2-二氟丙基、2,3-二氟丙基、2-氯丙基、3-氯丙基、2,3-二氯丙基、2-溴丙基、3-溴丙基、3,3,3-三氟丙基、3,3,3-三氯丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、七氟丙基、1-(氟甲基)-2-氟乙基、1-(氯丙基)-2-氯乙基、1-(溴甲基)-2-溴乙基、4-氟丁基、4-氯丁基、4-溴丁基和九氟丁基。

[0068] 环烷基以及例如在环烷氧基或环烷基羰基中的环烷基结构部分：具有 3 个或更多个碳原子，例如 3-6 个碳环成员的单环饱和烃基，如环丙基、环丁基、环戊基和环己基。

[0069] 链烯基以及例如在苯基- C_2 - C_6 链烯基或链烯基氨基中的链烯基结构部分：具有 2 个或更多个碳原子，例如 2-4 个、2-6 个或 3-6 个碳原子和在任意位置的双键的单不饱和直链或支化烃基，例如 C_2 - C_6 链烯基，如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、3,3-二甲基-2-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基、1-乙基-2-甲基-2-丙烯基。

[0070] 在本发明的一个实施方案中，使用诸如 C_2 - C_6 链烯基的链烯基。在本发明的另一实

施方案中,使用诸如 C_3-C_6 链烯基的链烯基。

[0071] 环烯基以及环烯基结构部分:具有 3 个或更多个碳原子,例如 3-6 个,优选 5-6 个碳环成员的单环单不饱和烃基,如环戊烯-1-基、环戊烯-3-基、环己烯-1-基、环己烯-3-基、环己烯-4-基。

[0072] 链炔基以及例如三- C_1-C_6 烷基甲硅烷基- C_2-C_6 链炔基或链炔基氨基中的链炔基结构部分:具有 2 个或更多个碳原子,例如 2-4 个、2-6 个或 3-6 个碳原子和在任意位置但不相互相邻的一根或两根叁键的直链或支化烃基,例如 C_2-C_6 链炔基,如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、3-甲基-1-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、1-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-1-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、4-甲基-1-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基、1-乙基-1-甲基-2-丙炔基。

[0073] 环炔基以及环炔基结构部分:具有 3 个或更多个碳原子,例如 3-6 个,优选 5-6 个碳环成员和一根叁键的单环烃基,如环己炔-1-基、环己炔-3-基、环己炔-4-基。

[0074] C_4-C_{10} 链二烯基:具有 4 个或更多个碳原子和在任意位置但不相互相邻的两根双键,例如 4-10 个碳原子和在任意位置但不相互相邻的两根双键的双重不饱和直链或支化烃基,例如 1,3-丁二烯基、1-甲基-1,3-丁二烯基、2-甲基-1,3-丁二烯基、戊-1,3-二烯-1-基、己-1,4-二烯-1-基、己-1,4-二烯-3-基、己-1,4-二烯-6-基、己-1,5-二烯-1-基、己-1,5-二烯-3-基、己-1,5-二烯-4-基、庚-1,4-二烯-1-基、庚-1,4-二烯-3-基、庚-1,4-二烯-6-基、庚-1,4-二烯-7-基、庚-1,5-二烯-1-基、庚-1,5-二烯-3-基、庚-1,5-二烯-4-基、庚-1,5-二烯-7-基、庚-1,6-二烯-1-基、庚-1,6-二烯-3-基、庚-1,6-二烯-4-基、庚-1,6-二烯-5-基、庚-1,6-二烯-2-基、辛-1,4-二烯-1-基、辛-1,4-二烯-2-基、辛-1,4-二烯-3-基、辛-1,4-二烯-6-基、辛-1,4-二烯-7-基、辛-1,5-二烯-1-基、辛-1,5-二烯-3-基、辛-1,5-二烯-4-基、辛-1,5-二烯-7-基、辛-1,6-二烯-1-基、辛-1,6-二烯-3-基、辛-1,6-二烯-4-基、辛-1,6-二烯-5-基、辛-1,6-二烯-2-基、癸-1,4-二烯基、癸-1,5-二烯基、癸-1,6-二烯基、癸-1,7-二烯基、癸-1,8-二烯基、癸-2,5-二烯基、癸-2,6-二烯基、癸-2,7-二烯基、癸-2,8-二烯基。

[0075] 烷氧基或例如在苯基烷氧基、烷氧基氨基、烷氧羰基中的烷氧基结构部分:经由氧原子连接的如上所定义的烷基:例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、1-甲基乙氧基、丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基或 1,1-二甲基乙氧基、戊氧基、1-甲基丁氧基、2-甲基丁氧基、3-甲基丁氧基、1,1-二甲基丙氧基、1,2-二甲基丙氧基、2,2-二甲基丙氧基、1-乙基丙氧基、己氧基、1-甲基戊氧基、2-甲基戊氧基、3-甲基戊氧基、4-甲基戊氧基、1,1-二甲基丁氧基、1,2-二甲基丁氧基、1,3-二甲基丁氧基、2,2-二甲基丁氧基、2,3-二甲基丁氧基、3,3-二甲基丁氧基、1-乙基丁氧基、2-乙基丁氧基、1,1,2-三甲基丙氧基、1,2,2-三甲基丙氧基、1-乙基-1-甲基丙氧基或 1-乙基-2-甲基丙氧基。

[0076] 在本发明的一个实施方案中,使用诸如 C_1 - C_4 烷氧基的小烷氧基。在本发明的另一实施方案中,使用诸如 C_5 - C_6 烷氧基的较大烷氧基。

[0077] 链烯氧基:经由氧原子连接的上述链烯基,例如 C_3 - C_6 链烯氧基,如 1-丙烯氧基、2-丙烯氧基、1-甲基乙烯氧基、1-丁烯氧基、2-丁烯氧基、3-丁烯氧基、1-甲基-1-丙烯氧基、2-甲基-1-丙烯氧基、1-甲基-2-丙烯氧基、2-甲基-2-丙烯氧基、1-戊烯氧基、2-戊烯氧基、3-戊烯氧基、4-戊烯氧基、1-甲基-1-丁烯氧基、2-甲基-1-丁烯氧基、3-甲基-1-丁烯氧基、1-甲基-2-丁烯氧基、2-甲基-2-丁烯氧基、3-甲基-2-丁烯氧基、1-甲基-3-丁烯氧基、2-甲基-3-丁烯氧基、3-甲基-3-丁烯氧基、1,1-二甲基-2-丙烯氧基、1,2-二甲基-1-丙烯氧基、1,2-二甲基-2-丙烯氧基、1-乙基-1-丙烯氧基、1-乙基-2-丙烯氧基、1-己烯氧基、2-己烯氧基、3-己烯氧基、4-己烯氧基、5-己烯氧基、1-甲基-1-戊烯氧基、2-甲基-1-戊烯氧基、3-甲基-1-戊烯氧基、4-甲基-1-戊烯氧基、1-甲基-2-戊烯氧基、2-甲基-2-戊烯氧基、3-甲基-2-戊烯氧基、4-甲基-2-戊烯氧基、1-甲基-3-戊烯氧基、2-甲基-3-戊烯氧基、3-甲基-3-戊烯氧基、4-甲基-3-戊烯氧基、1-甲基-4-戊烯氧基、2-甲基-4-戊烯氧基、3-甲基-4-戊烯氧基、4-甲基-4-戊烯氧基、1,1-二甲基-2-丁烯氧基、1,1-二甲基-3-丁烯氧基、1,2-二甲基-1-丁烯氧基、1,2-二甲基-2-丁烯氧基、1,2-二甲基-3-丁烯氧基、1,3-二甲基-1-丁烯氧基、1,3-二甲基-2-丁烯氧基、1,3-二甲基-3-丁烯氧基、2,2-二甲基-3-丁烯氧基、2,3-二甲基-1-丁烯氧基、2,3-二甲基-2-丁烯氧基、2,3-二甲基-3-丁烯氧基、3,3-二甲基-1-丁烯氧基、3,3-二甲基-2-丁烯氧基、1-乙基-1-丁烯氧基、1-乙基-2-丁烯氧基、1-乙基-3-丁烯氧基、2-乙基-1-丁烯氧基、2-乙基-2-丁烯氧基、2-乙基-3-丁烯氧基、1,1,2-三甲基-2-丙烯氧基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯氧基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯氧基和 1-乙基-2-甲基-2-丙烯氧基。在本发明的一个实施方案中,使用诸如 C_3 - C_4 链烯氧基的小链烯氧基。在本发明的另一实施方案中,使用诸如 C_5 - C_6 链烯氧基的较大链烯氧基。

[0078] 链炔氧基:经由氧原子连接的上述链炔基,例如 C_3 - C_6 链炔氧基,如 2-丙炔氧基、2-丁炔氧基、3-丁炔氧基、1-甲基-2-丙炔氧基、2-戊炔氧基、3-戊炔氧基、4-戊炔氧基、1-甲基-2-丁炔氧基、1-甲基-3-丁炔氧基、2-甲基-3-丁炔氧基、1-乙基-2-丙炔氧基、2-己炔氧基、3-己炔氧基、4-己炔氧基、5-己炔氧基、1-甲基-2-戊炔氧基、1-甲基-3-戊炔氧基。在本发明的一个实施方案中,使用诸如 C_3 - C_4 链炔氧基的小链炔氧基。在本发明的另一实施方案中,使用诸如 C_5 - C_6 链炔氧基的较大链炔氧基。

[0079] 烷硫基:经由硫原子连接的如上所定义的烷基。

[0080] 烷基亚磺酰基:经由 SO 基团连接的如上所定义的烷基。

[0081] 烷基磺酰基:经由 $S(O)_2$ 基团连接的如上所定义的烷基。

[0082] 烷基羰基:经由 $(C=O)$ 基团连接的如上所定义的烷基,例如甲基羰基、乙基羰基、丙基羰基、1-甲基乙基羰基、丁基羰基、1-甲基丙基羰基、2-甲基丙基羰基或 1,1-二甲基乙基羰基、戊基羰基、1-甲基丁基羰基、2-甲基丁基羰基、3-甲基丁基羰基、2,2-二甲基丙基羰基、1-乙基丙基羰基、己基羰基、1,1-二甲基丙基羰基、1,2-二甲基丙基羰基、1-甲基戊基羰基、2-甲基戊基羰基、3-甲基戊基羰基、4-甲基戊基羰基、1,1-二甲基丁基羰基、1,2-二甲基丁基羰基、1,3-二甲基丁基羰基、2,2-二甲基丁基羰基、2,3-二甲基丁基羰基、3,3-二甲基丁基羰基、1-乙基丁基羰基、2-乙基丁基羰基、1,1,2-三甲基丙基羰基、1,2,2-三

甲基丙基羰基、1-乙基-1-甲基丙基羰基或1-乙基-2-甲基丙基羰基。

[0083] 链烯基羰基：经由(C=O)基团连接的如上所定义的链烯基，例如1-乙烯基羰基。

[0084] 链炔基羰基：经由(C=O)基团连接的如上所定义的链炔基，例如1-丙炔基羰基。

[0085] 杂环基：具有3个或更多个，例如3-10个环原子的单环或双环饱和、部分不饱和或芳族杂环，例如含有1-4个选自氧、硫和氮的相同或不同杂原子且可以经由碳或氮连接的单环3-、4-、5-、6-或7员杂环，例如

[0086] 经由碳连接的3或4员饱和或不饱和环，如2-环氧乙烷基、2-氧杂环丁烷基、3-氧杂环丁烷基、2-吡丙啶基、3-硫杂环丁烷基(thiethanyl)、1-氮杂环丁烷基、2-氮杂环丁烷基。

[0087] 经由碳连接的5员饱和环，如四氢呋喃-2-基、四氢呋喃-3-基、四氢噻吩-2-基、四氢噻吩-3-基、四氢吡咯-2-基、四氢吡咯-3-基、四氢吡唑-3-基、四氢吡唑-4-基、四氢异噁唑-3-基、四氢异噁唑-4-基、四氢异噁唑-5-基、1,2-氧硫杂环戊-3-基、1,2-氧硫杂环戊-4-基、1,2-氧硫杂环戊-5-基、四氢异噻唑-3-基、四氢异噻唑-4-基、四氢异噻唑-5-基、1,2-二硫戊环-3-基、1,2-二硫戊环-4-基、四氢咪唑-2-基、四氢咪唑-4-基、四氢噁唑-2-基、四氢噁唑-4-基、四氢噁唑-5-基、四氢噻唑-2-基、四氢噻唑-4-基、四氢噻唑-5-基、1,3-二氧戊环-2-基、1,3-二氧戊环-4-基、1,3-氧硫杂环戊-2-基、1,3-氧硫杂环戊-4-基、1,3-氧硫杂环戊-5-基、1,3-二硫戊环-2-基、1,3-二硫戊环-4-基、1,3,2-二氧硫杂环戊-4-基。

[0088] 经由碳连接的6员饱和环，如四氢吡喃-2-基、四氢吡喃-3-基、四氢吡喃-4-基、哌啶-2-基、哌啶-3-基、哌啶-4-基、四氢噻喃-2-基、四氢噻喃-3-基、四氢噻喃-4-基、1,3-二噁烷-2-基、1,3-二噁烷-4-基、1,3-二噁烷-5-基、1,4-二噁烷-2-基、1,3-二噻烷-2-基、1,3-二噻烷-4-基、1,3-二噻烷-5-基、1,4-二噻烷-2-基、1,3-氧硫杂环己烷-2-基、1,3-氧硫杂环己烷-4-基、1,3-氧硫杂环己烷-5-基、1,3-氧硫杂环己烷-6-基、1,4-氧硫杂环己烷-2-基、1,4-氧硫杂环己烷-3-基、1,2-二噻烷-3-基、1,2-二噻烷-4-基、六氢嘧啶-2-基、六氢嘧啶-4-基、六氢嘧啶-5-基、六氢吡嗪-2-基、六氢吡嗪-3-基、六氢吡嗪-4-基、四氢-1,3-噁嗪-2-基、四氢-1,3-噁嗪-4-基、四氢-1,3-噁嗪-5-基、四氢-1,3-噁嗪-6-基、四氢-1,3-噻嗪-2-基、四氢-1,3-噻嗪-4-基、四氢-1,3-噻嗪-5-基、四氢-1,3-噻嗪-6-基、四氢-1,4-噻嗪-2-基、四氢-1,4-噻嗪-3-基、四氢-1,4-噁嗪-2-基、四氢-1,4-噁嗪-3-基、四氢-1,2-噁嗪-3-基、四氢-1,2-噁嗪-4-基、四氢-1,2-噁嗪-5-基、四氢-1,2-噁嗪-6-基。

[0089] 经由氮连接的5员饱和环，如四氢吡咯-1-基、四氢吡唑-1-基、四氢异噁唑-2-基、四氢异噻唑-2-基、四氢咪唑-1-基、四氢噁唑-3-基、四氢噻唑-3-基。

[0090] 经由氮连接的6员饱和环，如哌啶-1-基、六氢嘧啶-1-基、六氢吡嗪-1-基、六氢吡嗪-1-基、四氢-1,3-噁嗪-3-基、四氢-1,3-噻嗪-3-基、四氢-1,4-噻嗪-4-基、四氢-1,4-噁嗪-4-基、四氢-1,2-噁嗪-2-基。

[0091] 经由碳连接的5员部分不饱和环，如2,3-二氢呋喃-2-基、2,3-二氢呋喃-3-基、2,5-二氢呋喃-2-基、2,5-二氢呋喃-3-基、4,5-二氢呋喃-2-基、4,5-二氢呋喃-3-基、2,3-二氢噻吩-2-基、2,3-二氢噻吩-3-基、2,5-二氢噻吩-2-基、2,5-二氢噻吩-3-基、4,5-二氢噻吩-2-基、4,5-二氢噻吩-3-基、2,3-二氢-1H-吡咯-2-基、2,3-二氢-1H-吡

咯-3-基、2,5-二氢-1H-吡咯-2-基、2,5-二氢-1H-吡咯-3-基、4,5-二氢-1H-吡咯-2-基、4,5-二氢-1H-吡咯-3-基、3,4-二氢-2H-吡咯-2-基、3,4-二氢-2H-吡咯-3-基、3,4-二氢-5H-吡咯-2-基、3,4-二氢-5H-吡咯-3-基、4,5-二氢-1H-吡唑-3-基、4,5-二氢-1H-吡唑-4-基、4,5-二氢-1H-吡唑-5-基、2,5-二氢-1H-吡唑-3-基、2,5-二氢-1H-吡唑-4-基、2,5-二氢-1H-吡唑-5-基、4,5-二氢异噁唑-3-基、4,5-二氢异噁唑-4-基、4,5-二氢异噁唑-5-基、2,5-二氢异噁唑-3-基、2,5-二氢异噁唑-4-基、2,5-二氢异噁唑-5-基、2,3-二氢异噁唑-3-基、2,3-二氢异噁唑-4-基、2,3-二氢异噁唑-5-基、4,5-二氢异噻唑-3-基、4,5-二氢异噻唑-4-基、4,5-二氢异噻唑-5-基、2,5-二氢异噻唑-3-基、2,5-二氢异噻唑-4-基、2,5-二氢异噻唑-5-基、2,3-二氢异噻唑-3-基、2,3-二氢异噻唑-4-基、2,3-二氢异噻唑-5-基、 Δ^3 -1,2-二硫杂环戊二烯-3-基、 Δ^3 -1,2-二硫杂环戊二烯-4-基、 Δ^3 -1,2-二硫杂环戊二烯-5-基、4,5-二氢-1H-咪唑-2-基、4,5-二氢-1H-咪唑-4-基、4,5-二氢-1H-咪唑-5-基、2,5-二氢-1H-咪唑-2-基、2,5-二氢-1H-咪唑-4-基、2,5-二氢-1H-咪唑-5-基、2,3-二氢-1H-咪唑-2-基、2,3-二氢-1H-咪唑-4-基、4,5-二氢噁唑-2-基、4,5-二氢噁唑-4-基、4,5-二氢噁唑-5-基、2,5-二氢噁唑-2-基、2,5-二氢噁唑-4-基、2,5-二氢噁唑-5-基、2,3-二氢噁唑-2-基、2,3-二氢噁唑-4-基、2,3-二氢噁唑-5-基、4,5-二氢噻唑-2-基、4,5-二氢噻唑-4-基、4,5-二氢噻唑-5-基、2,5-二氢噻唑-2-基、2,5-二氢噻唑-4-基、2,5-二氢噻唑-5-基、2,3-二氢噻唑-2-基、2,3-二氢噻唑-4-基、2,3-二氢噻唑-5-基、1,3-二氧杂环戊烯-2-基、1,3-二氧杂环戊烯-4-基、1,3-二硫杂环戊二烯-2-基、1,3-二硫杂环戊二烯-4-基、1,3-氧硫杂环戊烯-2-基、1,3-氧硫杂环戊烯-4-基、1,3-氧硫杂环戊烯-5-基、1,2,3- Δ^2 -噁二唑啉-4-基、1,2,3- Δ^2 -噁二唑啉-5-基、1,2,4- Δ^4 -噁二唑啉-3-基、1,2,4- Δ^4 -噁二唑啉-5-基、1,2,4- Δ^2 -噁二唑啉-3-基、1,2,4- Δ^2 -噁二唑啉-5-基、1,2,4- Δ^3 -噁二唑啉-3-基、1,2,4- Δ^3 -噁二唑啉-5-基、1,3,4- Δ^2 -噁二唑啉-2-基、1,3,4- Δ^2 -噁二唑啉-5-基、1,3,4- Δ^3 -噁二唑啉-2-基、1,3,4-噁二唑啉-2-基、1,2,4- Δ^4 -噻二唑啉-3-基、1,2,4- Δ^4 -噻二唑啉-5-基、1,2,4- Δ^3 -噻二唑啉-3-基、1,2,4- Δ^3 -噻二唑啉-5-基、1,3,4- Δ^2 -噻二唑啉-2-基、1,3,4- Δ^2 -噻二唑啉-5-基、1,3,4- Δ^3 -噻二唑啉-2-基、1,3,4-噻二唑啉-2-基、1,2,3- Δ^2 -三唑啉-4-基、1,2,3- Δ^2 -三唑啉-5-基、1,2,4- Δ^2 -三唑啉-3-基、1,2,4- Δ^2 -三唑啉-5-基、1,2,4- Δ^3 -三唑啉-3-基、1,2,4- Δ^3 -三唑啉-5-基、1,2,4- Δ^1 -三唑啉-2-基、1,2,4-三唑啉-3-基、3H-1,2,4-二噻唑-5-基、2H-1,3,4-二噻唑-5-基、2H-1,3,4-噁噻唑-5-基。

[0092] 经由碳连接的6员部分不饱和环如2H-3,4-二氢吡喃-6-基、2H-3,4-二氢吡喃-5-基、2H-3,4-二氢吡喃-4-基、2H-3,4-二氢吡喃-3-基、2H-3,4-二氢吡喃-2-基、2H-3,4-二氢噻喃-6-基、2H-3,4-二氢噻喃-5-基、2H-3,4-二氢噻喃-4-基、2H-3,4-二氢噻喃-3-基、2H-3,4-二氢噻喃-2-基、1,2,3,4-四氢吡啶-6-基、1,2,3,4-四氢吡啶-5-基、1,2,3,4-四氢吡啶-4-基、1,2,3,4-四氢吡啶-3-基、1,2,3,4-四氢吡啶-2-基、2H-5,6-二氢吡喃-2-基、2H-5,6-二氢吡喃-3-基、2H-5,6-二氢吡喃-4-基、2H-5,6-二氢吡喃-5-基、2H-5,6-二氢吡喃-6-基、2H-5,6-二氢噻喃-2-基、2H-5,6-二氢噻喃-3-基、2H-5,6-二氢噻喃-4-基、2H-5,6-二氢噻喃-5-基、2H-5,6-二氢噻喃-6-基、

1,2,5,6-四氢吡啶-2-基、1,2,5,6-四氢吡啶-3-基、1,2,5,6-四氢吡啶-4-基、1,2,5,6-四氢吡啶-5-基、1,2,5,6-四氢吡啶-6-基、2,3,4,5-四氢吡啶-2-基、2,3,4,5-四氢吡啶-3-基、2,3,4,5-四氢吡啶-4-基、2,3,4,5-四氢吡啶-5-基、2,3,4,5-四氢吡啶-6-基、4H-吡喃-2-基、4H-吡喃-3-基、4H-吡喃-4-基、4H-噻喃-2-基、4H-噻喃-3-基、4H-噻喃-4-基、1,4-二氢吡啶-2-基、1,4-二氢吡啶-3-基、1,4-二氢吡啶-4-基、2H-吡喃-2-基、2H-吡喃-3-基、2H-吡喃-4-基、2H-吡喃-5-基、2H-吡喃-6-基、2H-噻喃-2-基、2H-噻喃-3-基、2H-噻喃-4-基、2H-噻喃-5-基、2H-噻喃-6-基、1,2-二氢吡啶-2-基、1,2-二氢吡啶-3-基、1,2-二氢吡啶-4-基、1,2-二氢吡啶-5-基、1,2-二氢吡啶-6-基、3,4-二氢吡啶-2-基、3,4-二氢吡啶-3-基、3,4-二氢吡啶-4-基、3,4-二氢吡啶-5-基、3,4-二氢吡啶-6-基、2,5-二氢吡啶-2-基、2,5-二氢吡啶-3-基、2,5-二氢吡啶-4-基、2,5-二氢吡啶-5-基、2,5-二氢吡啶-6-基、2,3-二氢吡啶-2-基、2,3-二氢吡啶-3-基、2,3-二氢吡啶-4-基、2,3-二氢吡啶-5-基、2,3-二氢吡啶-6-基、2H-5,6-二氢-1,2-噁嗪-3-基、2H-5,6-二氢-1,2-噁嗪-4-基、2H-5,6-二氢-1,2-噁嗪-5-基、2H-5,6-二氢-1,2-噁嗪-6-基、2H-5,6-二氢-1,2-噻嗪-3-基、2H-5,6-二氢-1,2-噻嗪-4-基、2H-5,6-二氢-1,2-噻嗪-5-基、2H-5,6-二氢-1,2-噻嗪-6-基、4H-5,6-二氢-1,2-噁嗪-3-基、4H-5,6-二氢-1,2-噁嗪-4-基、4H-5,6-二氢-1,2-噁嗪-5-基、4H-5,6-二氢-1,2-噁嗪-6-基、4H-5,6-二氢-1,2-噻嗪-3-基、4H-5,6-二氢-1,2-噻嗪-4-基、4H-5,6-二氢-1,2-噻嗪-5-基、4H-5,6-二氢-1,2-噻嗪-6-基、2H-3,6-二氢-1,2-噁嗪-3-基、2H-3,6-二氢-1,2-噁嗪-4-基、2H-3,6-二氢-1,2-噁嗪-5-基、2H-3,6-二氢-1,2-噁嗪-6-基、2H-3,6-二氢-1,2-噻嗪-3-基、2H-3,6-二氢-1,2-噻嗪-4-基、2H-3,6-二氢-1,2-噻嗪-5-基、2H-3,6-二氢-1,2-噻嗪-6-基、2H-3,4-二氢-1,2-噁嗪-3-基、2H-3,4-二氢-1,2-噁嗪-4-基、2H-3,4-二氢-1,2-噁嗪-5-基、2H-3,4-二氢-1,2-噁嗪-6-基、2H-3,4-二氢-1,2-噻嗪-3-基、2H-3,4-二氢-1,2-噻嗪-4-基、2H-3,4-二氢-1,2-噻嗪-5-基、2H-3,4-二氢-1,2-噻嗪-6-基、2,3,4,5-四氢哒嗪-3-基、2,3,4,5-四氢哒嗪-4-基、2,3,4,5-四氢哒嗪-5-基、2,3,4,5-四氢哒嗪-6-基、3,4,5,6-四氢哒嗪-3-基、3,4,5,6-四氢哒嗪-4-基、1,2,5,6-四氢哒嗪-3-基、1,2,5,6-四氢哒嗪-4-基、1,2,5,6-四氢哒嗪-5-基、1,2,5,6-四氢哒嗪-6-基、1,2,3,6-四氢哒嗪-3-基、1,2,3,6-四氢哒嗪-4-基、4H-5,6-二氢-1,3-噁嗪-2-基、4H-5,6-二氢-1,3-噁嗪-4-基、4H-5,6-二氢-1,3-噁嗪-5-基、4H-5,6-二氢-1,3-噁嗪-6-基、4H-5,6-二氢-1,3-噻嗪-2-基、4H-5,6-二氢-1,3-噻嗪-4-基、4H-5,6-二氢-1,3-噻嗪-5-基、4H-5,6-二氢-1,3-噻嗪-6-基、3,4,5,6-四氢嘧啶-2-基、3,4,5,6-四氢嘧啶-4-基、3,4,5,6-四氢嘧啶-5-基、3,4,5,6-四氢嘧啶-6-基、1,2,3,4-四氢吡嗪-2-基、1,2,3,4-四氢吡嗪-5-基、1,2,3,4-四氢嘧啶-2-基、1,2,3,4-四氢嘧啶-4-基、1,2,3,4-四氢嘧啶-5-基、1,2,3,4-四氢嘧啶-6-基、2,3-二氢-1,4-噻嗪-2-基、2,3-二氢-1,4-噻嗪-3-基、2,3-二氢-1,4-噻嗪-5-基、2,3-二氢-1,4-噻嗪-6-基、2H-1,2-噁嗪-3-基、2H-1,2-噁嗪-4-基、2H-1,2-噁嗪-5-基、2H-1,2-噁嗪-6-基、2H-1,2-噻嗪-3-基、2H-1,2-噻嗪-4-基、2H-1,2-噻嗪-5-基、2H-1,2-噻嗪-6-基、4H-1,2-噁嗪-3-基、4H-1,2-噁嗪-4-基、4H-1,2-噁嗪-5-基、4H-1,2-噁嗪-6-基、4H-1,2-噻嗪-3-基、4H-1,2-噻嗪-4-基、4H-1,2-噻嗪-5-基、4H-1,2-噻嗪-6-基、6H-1,2-噁嗪-3-基、6H-1,

2-噁嗪-4-基、6H-1,2-噁嗪-5-基、6H-1,2-噁嗪-6-基、6H-1,2-噻嗪-3-基、6H-1,2-噻嗪-4-基、6H-1,2-噻嗪-5-基、6H-1,2-噻嗪-6-基、2H-1,3-噁嗪-2-基、2H-1,3-噁嗪-4-基、2H-1,3-噁嗪-5-基、2H-1,3-噁嗪-6-基、2H-1,3-噻嗪-2-基、2H-1,3-噻嗪-4-基、2H-1,3-噻嗪-5-基、2H-1,3-噻嗪-6-基、4H-1,3-噁嗪-2-基、4H-1,3-噁嗪-4-基、4H-1,3-噁嗪-5-基、4H-1,3-噁嗪-6-基、4H-1,3-噻嗪-2-基、4H-1,3-噻嗪-4-基、4H-1,3-噻嗪-5-基、4H-1,3-噻嗪-6-基、6H-1,3-噁嗪-2-基、6H-1,3-噁嗪-4-基、6H-1,3-噁嗪-5-基、6H-1,3-噁嗪-6-基、6H-1,3-噻嗪-2-基、6H-1,3-噻嗪-4-基、6H-1,3-噻嗪-5-基、6H-1,3-噻嗪-6-基、2H-1,4-噁嗪-2-基、2H-1,4-噁嗪-3-基、2H-1,4-噁嗪-5-基、2H-1,4-噁嗪-6-基、2H-1,4-噻嗪-2-基、2H-1,4-噻嗪-3-基、2H-1,4-噻嗪-5-基、2H-1,4-噻嗪-6-基、4H-1,4-噁嗪-2-基、4H-1,4-噁嗪-3-基、4H-1,4-噻嗪-2-基、4H-1,4-噻嗪-3-基、1,4-二氢吡嗪-3-基、1,4-二氢吡嗪-4-基、1,4-二氢吡嗪-5-基、1,4-二氢吡嗪-6-基、1,4-二氢吡嗪-2-基、1,2-二氢吡嗪-2-基、1,2-二氢吡嗪-3-基、1,2-二氢吡嗪-5-基、1,2-二氢吡嗪-6-基、1,4-二氢嘧啶-2-基、1,4-二氢嘧啶-4-基、1,4-二氢嘧啶-5-基、1,4-二氢嘧啶-6-基、3,4-二氢嘧啶-2-基、3,4-二氢嘧啶-4-基、3,4-二氢嘧啶-5-基或3,4-二氢嘧啶-6-基。

[0093] 经由氮连接的5员部分不饱和环,如2,3-二氢-1H-吡咯-1-基、2,5-二氢-1H-吡咯-1-基、4,5-二氢-1H-吡唑-1-基、2,5-二氢-1H-吡唑-1-基、2,3-二氢-1H-吡唑-1-基、2,5-二氢异噁唑-2-基、2,3-二氢异噁唑-2-基、2,5-二氢异噻唑-2-基、2,3-二氢异噻唑-2-基、4,5-二氢-1H-咪唑-1-基、2,5-二氢-1H-咪唑-1-基、2,3-二氢-1H-咪唑-1-基、2,3-二氢噁唑-3-基、2,3-二氢噻唑-3-基、1,2,4- Δ^4 -噁二唑啉-2-基、1,2,4- Δ^2 -噁二唑啉-4-基、1,2,4- Δ^3 -噁二唑啉-2-基、1,3,4- Δ^2 -噁二唑啉-4-基、1,2,4- Δ^5 -噻二唑啉-2-基、1,2,4- Δ^3 -噻二唑啉-2-基、1,2,4- Δ^2 -噻二唑啉-4-基、1,3,4- Δ^2 -噻二唑啉-4-基、1,2,3- Δ^2 -三唑啉-1-基、1,2,4- Δ^2 -三唑啉-1-基、1,2,4- Δ^2 -三唑啉-4-基、1,2,4- Δ^3 -三唑啉-1-基、1,2,4- Δ^1 -三唑啉-4-基。

[0094] 经由氮连接的6员部分不饱和环,如1,2,3,4-四氢吡啶-1-基、1,2,5,6-四氢吡啶-1-基、1,4-二氢吡啶-1-基、1,2-二氢吡啶-1-基、2H-5,6-二氢-1,2-噁嗪-2-基、2H-5,6-二氢-1,2-噻嗪-2-基、2H-3,6-二氢-1,2-噁嗪-2-基、2H-3,6-二氢-1,2-噻嗪-2-基、2H-3,4-二氢-1,2-噁嗪-2-基、2H-3,4-二氢-1,2-噻嗪-2-基、2,3,4,5-四氢哒嗪-2-基、1,2,5,6-四氢哒嗪-1-基、1,2,5,6-四氢哒嗪-2-基、1,2,3,6-四氢哒嗪-1-基、3,4,5,6-四氢嘧啶-3-基、1,2,3,4-四氢吡嗪-1-基、1,2,3,4-四氢嘧啶-1-基、1,2,3,4-四氢嘧啶-3-基、2,3-二氢-1,4-噻嗪-4-基、2H-1,2-噁嗪-2-基、2H-1,2-噻嗪-2-基、4H-1,4-噁嗪-4-基、4H-1,4-噻嗪-4-基、1,4-二氢哒嗪-1-基、1,4-二氢吡嗪-1-基、1,2-二氢吡嗪-1-基、1,4-二氢嘧啶-1-基或3,4-二氢嘧啶-3-基。

[0095] 经由碳连接的通常具有1、2、3或4个氮原子或一个选自氧和硫的杂原子以及合适的话1、2或3个氮原子作为环成员的5员杂芳族环,如2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、吡咯-2-基、吡咯-3-基、吡唑-3-基、吡唑-4-基、异噁唑-3-基、异噁唑-4-基、异噁唑-5-基、异噻唑-3-基、异噻唑-4-基、异噻唑-5-基、咪唑-2-基、咪唑-4-基、噁唑-2-基、噁唑-4-基、噁唑-5-基、噻唑-2-基、噻唑-4-基、噻唑-5-基、1,2,3-噁二唑-4-基、1,2,3-噁二唑-5-基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,3,4-噁二

唑-2-基、1,2,3-噻二唑-4-基、1,2,3-噻二唑-5-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,3,4-噻二唑-2-基、1,2,3-三唑-4-基、1,2,4-三唑-3-基、四唑-5-基。

[0096] 经由碳连接且通常具有 1、2、3 或 4 个氮原子作为环成员的 6 员杂芳族环,如吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、哒嗪-3-基、哒嗪-4-基、嘧啶-2-基、嘧啶-4-基、嘧啶-5-基、吡嗪-2-基、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、1,2,4,5-四嗪-3-基。

[0097] 经由氮连接且通常具有 1、2、3 或 4 个氮原子作为环成员的 5 员杂芳族环,如吡咯-1-基、吡唑-1-基、咪唑-1-基、1,2,3-三唑-1-基、1,2,4-三唑-1-基、四唑-1-基。

[0098] 或包含上述 5 或 6 员杂环之一和另一稠合的饱和、不饱和或芳族碳环如苯、环己烷、环己烯或环己二烯环或另一稠合的 5 或 6 员杂环的双环杂环,其中所述另一稠合的 5 或 6 员杂环同样可以是饱和、不饱和或芳族的。

[0099] 所述杂环中的硫原子可以被氧化成 $S=O$ 或 $S(=O)_2$ 。

[0100] 因此,杂芳基是具有 1、2、3 或 4 个选自氧、硫和氮的相同或不同杂原子作为环成员的 5 或 6 员杂芳族基团,其可以经由碳或氮连接且可以与另一稠合苯环或 5-6 员杂芳族基团一起形成双环体系。杂芳基的实例是上述经由碳连接的 5 和 6 员杂芳族环,经由氮连接的上述 5 员杂芳族环以及双环杂芳族基团,如喹啉基、异喹啉基、喹唑啉基、喹喔啉基、吲哚基、苯并噻吩基、苯并呋喃基、苯并噁唑基、苯并噻唑基、苯并咪唑基、苯并吡唑基、苯并三唑基、中氮茛基、1,2,4-三唑并 [1,5-a] 嘧啶基、1,2,4-三唑并 [4,3-a] 吡啶基、吡啶并 [3,4-b] 吡啶基、1,2,4-三唑并 [1,5-a] 吡啶基、咪唑并 [1,2-a] 吡啶基、咪唑并 [3,4-a] 嘧啶基等。

[0101] 芳基:具有 6-14 个环成员的单环或多环芳族碳环,例如单环或双环或单环至三环芳族碳环,如苯基、萘基或蒽基。

[0102] 芳基烷基:经由亚烷基连接,尤其是经由亚甲基、1,1-亚乙基或 1,2-亚乙基连接的芳基,例如苄基、1-苯基乙基和 2-苯基乙基。

[0103] 杂环基烷基和杂芳基烷基:经由亚烷基连接,尤其是经由亚甲基、1,1-亚乙基或 1,2-亚乙基连接的杂环基或杂芳基。

[0104] 在特殊实施方案中,式 I 化合物的各变量具有下述含义,这些含义本身和相互结合地为式 I 化合物的特殊实施方案:

[0105] R^1 为氢、氨基、氰基、 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 链烯基、 C_3-C_6 链炔基、苯基- C_1-C_6 烷基、杂环基- C_1-C_6 烷基或 COR^{21} ,其中 R^{21} 如上所定义且尤其为 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、苯基、苯基氨基或杂环基;其中取代基的上述脂族、环状或芳族结构部分可以部分或完全被卤代。特别优选 R^1 为氢或 C_1-C_6 烷基,尤其是甲基。

[0106] R^2 为氨基、氰基、 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 链烯基、 C_3-C_6 链炔基、苯基- C_1-C_6 烷基、杂环基- C_1-C_6 烷基或 COR^{21} ,其中 R^{21} 如上所定义且尤其为 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷氧基、苯基、苯基氨基或杂环基;其中取代基的上述脂族、环状或芳族结构部分可以部分或完全被卤代。特别优选 R^2 为 C_1-C_6 烷基,尤其是甲基。

[0107] R^3 为基团 R^{26} 或基团 OR^{27} ,其中 R^{26} 和 R^{27} 如上所定义且尤其相互独立地为氢、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 烷基羰基、苯基- C_1-C_6 烷基或苯基羰基,其中取代基的上述脂族或芳族结构部分可部分或全部被卤代或为 SO_2R^{31} ,其中 R^{31} 为 C_1-C_6 烷基或苯基且其中 R^{31} 中的苯基取代基可

部分或全部被卤代和 / 或可带有 1-3 个 C_1-C_6 烷基。特别优选 R^3 具有如下含义 : 氢、 C_1-C_6 烷基、苯基、 C_1-C_6 烷氧基或 C_1-C_6 烷基磺酰基。

[0108] R^4 、 R^5 和 / 或 R^6 为氢。

[0109] R^3 和 R^4 也可一起为酮基。此时, R^5 和 / 或 R^6 优选为氢。

[0110] R^7 和 R^8 相互独立地优选为氢或甲基, 尤其是氢。

[0111] A^1 、 A^2 相互独立地为选自如下的芳基或杂芳基 : 苯基、萘基、呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡啶基、噻唑基、异噻唑基、噁唑基、异噁唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、三嗪基或四嗪基, 尤其是选自如下的芳基或杂芳基 : 苯基、呋喃基、噻吩基、三唑基、四唑基或吡啶基。特别优选 A^1 具有苯基或吡啶基, 尤其是苯基的含义。特别优选 A^2 具有苯基或噻吩基, 尤其是苯基的含义。

[0112] 根据本发明, A^1 具有 1-3 个不同于氢的取代基 R^a 、 R^b 、 R^c , 其中 R^a 在 A^1 的连接点的邻位与 A^1 的氮原子或碳原子连接, 其中 R^a 优选具有如下含义之一 :

[0113] - 卤素、氰基、硝基、 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 链炔基、[三 (C_1-C_6) 烷基甲硅烷基]- (C_2-C_6) 链炔基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷基亚磺酰基、芳基、杂环基, 尤其是 5- 或 6- 元杂环基, 其中芳基和杂环基未被取代或可具有 1 或 2 个选自如下的基团 : 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、CN、苯基和卤素, $-Z^1P(O)(OR^9)_2$, 其中 Z^1 为键或 $-CH_2-$ 且基团 R^9 各自为氢或 C_1-C_6 烷基 ; $-Z^3COR^{11}$, 其中 Z^3 为键且 R^{11} 具有上述含义且尤其为氢、 C_1-C_6 烷基、羟基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_3-C_6 链烯基氧基、 C_3-C_6 链炔基氧基、氨基、 C_1-C_6 烷基氨基、[二 (C_1-C_6) 烷基] 氨基、 C_1-C_6 烷氧基氨基、 $N-C_1-C_6$ 烷氧基、 $N-C_1-C_6$ 烷基氨基、[二 (C_1-C_6) 烷氧基] 氨基、 C_1-C_6 烷基磺酰氨基、 C_1-C_6 烷基氨基磺酰氨基、[二 (C_1-C_6) 烷基氨基] 磺酰氨基、苯基、苯氧基、苯基氨基、萘基或杂环基, 特别是经由碳连接的 5 或 6 元杂芳基 ;

[0114] $-Z^4NR^{12}R^{13}$, 其中 Z^4 为键或 $-CH_2-$ 且 R^{12} 和 R^{13} 具有上述含义且尤其相互独立地为氢、 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 链烯基、 C_3-C_6 链炔基、 C_1-C_6 烷基羰基、[二 (C_1-C_6) 烷基氨基] 羰基、 C_1-C_6 烷氧羰基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、 C_1-C_6 烷基氨基磺酰基、[二 (C_1-C_6) 烷基氨基] 磺酰基、 C_3-C_6 环烷基羰基、苯基羰基、苯基氨基羰基、苯基磺酰基、苯基磺酰氨基羰基或杂环基羰基, 特别是经由碳连接的 5 或 6 元杂芳基羰基 ;

[0115] $-Z^5CH=N-O-R^{14}$, 其中 Z^5 为键且 R^{14} 为氢或 C_1-C_6 烷基 ; 或

[0116] $-Z^6OR^{15}$, 其中 Z^6 为键或 $-CH_2-$ 且 R^{15} 具有上述含义且尤其为 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 链烯基、 C_3-C_6 链炔基、 C_1-C_6 烷基羰基、 C_1-C_6 烷氧羰基、(C_1-C_6) 烷基、二 (C_1-C_6 烷氧羰基) - C_1-C_6 烷基、苯基羰基、苯基或苯基 - (C_1-C_6) 烷基, R^{15} 也可作为氢或 C_1-C_6 烷基 ; 或

[0117] $-Z^7SO_2R^{16}$, 其中 Z^7 为键或 CH_2 且 R^{16} 为 C_1-C_6 烷基或苯基 ;

[0118] 其中取代基 R^a 的上述脂族、环状或芳族结构部分可部分或全部被卤代。

[0119] R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 优选为氢且相互独立地具有对 R^a 提及的优选含义之一。

[0120] 如果 R^a 与氮原子连接, 则 R^a 优选不同于卤素、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷基亚磺酰基、 $Z^1P(O)(OR^9)_2$, 其中 Z^1 为键。在本发明的优选实施方案中, R^a 与碳原子连接。

[0121] R^a 尤其具有下列含义之一 :

[0122] - 卤素、氰基、硝基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 烷基亚磺酰基、芳基、杂环基, 其中最后提及的两个基团未被取代或可带有 1 或 2 个选自如下的基团 : 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、CN、苯基和卤素，

[0123] $-C_2-C_6$ 链烯基、 C_2-C_6 链炔基，

[0124] $-Z^1P(O)(OR^9)_2$ ，其中 Z^1 为键或 $-CH_2-$ 和基团 R^9 各自为氢或 C_1-C_6 烷基；或

[0125] $-Z^3COR^{11}$ ，其中 Z^3 为键和 R^{11} 为氢、 C_1-C_6 烷基、羟基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_3-C_6 链烯基氧基、 C_3-C_6 链炔基氧基、氨基、 C_1-C_6 烷基氨基、[二 (C_1-C_6) 烷基] 氨基、 C_1-C_6 烷氧基氨基、 $N-C_1-C_6$ 烷氧基 $-N-C_1-C_6$ 烷基氨基、 C_1-C_6 烷基磺酰氨基、 C_1-C_6 烷基氨基磺酰氨基、[二 (C_1-C_6) 烷基氨基] 磺酰氨基、苯基、苯氧基、苯基氨基、萘基或杂环基，特别是经由碳连接的 5 或 6 元杂芳基；或

[0126] $-Z^4NR^{12}R^{13}$ ，其中 Z^4 为键或 $-CH_2-$ 且 R^{12} 和 R^{13} 相互独立地为氢、 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 链烯基、 C_3-C_6 链炔基、 C_1-C_6 烷基羰基、[二 (C_1-C_6) 烷基氨基] 羰基、 C_1-C_6 烷氧羰基、 C_1-C_6 烷基磺酰基、苯基羰基、苯基磺酰基或杂环基羰基，特别是经由碳连接的 5 或 6 元杂芳基羰基；或

[0127] $-Z^5CH=N-O-R^{14}$ ，其中 Z^5 为键且 R^{14} 为氢或 C_1-C_6 烷基；或

[0128] $-Z^6OR^{15}$ ，其中 Z^6 为键或 $-CH_2-$ 且 R^{15} 为氢、 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 链烯基、 C_3-C_6 链炔基、 C_1-C_6 烷基羰基、 C_1-C_6 烷氧羰基 $-(C_1-C_6)$ 烷基、苯基或苯基 $-(C_1-C_6)$ 烷基；或

[0129] $-Z^7SO_2R^{16}$ ，其中 Z^7 为键或 CH_2 且 R^{16} 为 C_1-C_6 烷基或苯基；

[0130] 以及其中取代基 R^a 的上述脂族、环状或芳族结构部分可部分或全部被卤代。

[0131] 非常特别优选， R^a 为选自如下的基团：卤素、氰基、硝基、 C_2-C_4 链烯基和 C_2-C_4 链炔基、 $NH-C(O)-C_1-C_6$ 烷基、 $NH-S(O)_2-C_1-C_6$ 烷基和 5 元杂芳基，例如噁唑基、噻唑基、异噁唑基、异噻唑基，其中上述杂芳基可具有 1 或 2 个选自如下的基团： C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 卤代烷基和卤素，且该杂芳基尤其与 A^1 的一个邻位连接。

[0132] R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 尤其为氢或相互独立地具有对 R^a 提及的特别优选的含义之一或为： C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 卤代烷基、可部分或全部被卤代的 C_3-C_6 环烷基、可部分或全部被卤代的 C_2-C_6 链烯基、[三 (C_1-C_6) 烷基甲硅烷基] $-(C_2-C_6)$ 链炔基或基团 Z^6OR^{15} ，其中 Z^6 为键且 R^{15} 为氢、 C_1-C_6 烷基或卤代烷基。

[0133] 基团 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 尤其相互独立地选自氢、卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 链炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷基和 C_1-C_4 卤代烷氧基，其中与 A^1 或 A^2 的相邻碳原子连接的两个基团 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 或 R^f 也可作为基团 $O-CH_2-O$ 。

[0134] R^6 尤其为不同于氢的基团。 R^6 优选为在 A^1 的邻位连接的基团，即如果 R^a 同样连接在邻位，则 R^b 在第二个邻位。

[0135] 如果 R^b 、 R^c 中的一个或两个为不同于氢的取代基，则它们尤其选自作为优选所述的取代基，特别是选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_2-C_4 链烯基、 C_2-C_4 链炔基和 C_1-C_4 卤代烷氧基，或 R^b 和 R^c 一起为基团 $O-CH_2-O$ 。

[0136] A^2 尤其是未取代的，或取代基 R^d 、 R^e 和 R^f 中的一个或两个为不同于氢的取代基。如果取代基 R^d 、 R^e 和 R^f 中的 1 或 2 个为不同于氢的取代基，则它们尤其选自卤素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 卤代烷基和 C_1-C_4 卤代烷氧基。

[0137] 在本发明上下文中取代基可采用的含义完全独立于在本发明上下文中另一取代基可采用的含义。

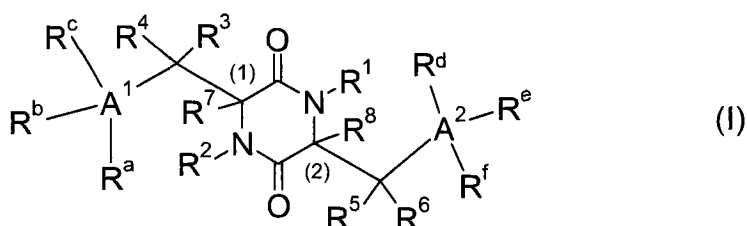
[0138] 本发明尤其提供了如下通式 I 的哌嗪化合物，其中 A^1 和 A^2 为苯基、 R^1 为甲基且 R^2

为氢、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 链炔基、芳基或 C_1-C_6 烷氧基,尤其是氢或甲基,取代基 R^a 和 R^b 各自相互独立地为氢、羟基、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 链炔基或 C_1-C_6 烷氧基,它们位于苯环 A^1 的两个邻位, R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 为氢和 R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 同样为氢。其中,优选其中 R^a 为 C_2-C_6 链烯基或 C_2-C_6 链炔基的化合物。

[0139] 本发明进一步提供了不同于上述特定主题化合物的式 I 的哌嗪化合物,即如下式 I 化合物之外的通式 I 的化合物:其中 R^1 为甲基且 R^2 为氢、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 链炔基、芳基或 C_1-C_6 烷氧基,尤其是氢或甲基,取代基 R^a 和 R^b 各自相互独立地为氢、羟基、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基、 C_2-C_6 链炔基或 C_1-C_6 烷氧基,它们位于苯环 A^1 的两个邻位, R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 为氢且 R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 同样为氢。

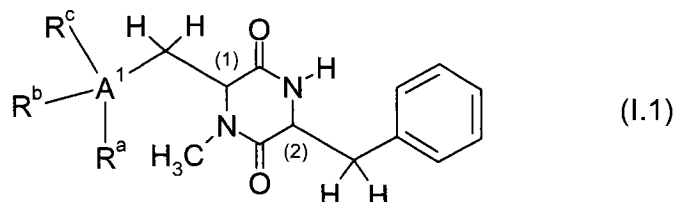
[0140] 本发明还优选提供了在所指出的 (1) 和 (2) 位均具有 S- 构型的式 I (S, S) 的那些化合物:

[0141]



[0142] 优选其中 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 和 R^8 为氢且 R^2 为 CH_3 的式 I. 1 的化合物,特别优选在所指出的 (1) 和 (2) 位均具有 S- 构型的化合物 (S, S)-I. 1。优选化合物 I. 1 的实例为其中 A^1 、 R^a 、 R^b 和 R^c 具有表 1 所给含义的化合物:

[0143]



[0144] 下列化合物 I. 2-I. 252 本身为本发明的优选实施方案。

[0145] 表 1

[0146]

化合物序号	A^1	R^a	R^b 或 H	R^c 或 H
I. 1. 1	苯基	2- NO_2	H	H
I. 1. 2	苯基	2- NO_2	3-Cl	H
I. 1. 3	苯基	2- NO_2	4-Cl	H
I. 1. 4	苯基	2- NO_2	5-Cl	H
I. 1. 5	苯基	2- NO_2	6-Cl	H

I. 1. 6	苯基	2-NO ₂	3-F	H
I. 1. 7	苯基	2-NO ₂	4-F	H
I. 1. 8	苯基	2-NO ₂	5-F	H
I. 1. 9	苯基	2-NO ₂	6-F	H
I. 1. 10	苯基	2-NO ₂	3-CH ₃	H
I. 1. 11	苯基	2-NO ₂	4-CH ₃	H
I. 1. 12	苯基	2-NO ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 13	苯基	2-NO ₂	6-CH ₃	H
I. 1. 14	苯基	2-NO ₂	5- 乙烯基	H
I. 1. 15	苯基	2-NO ₂	6- 乙烯基	H
I. 1. 16	苯基	2-NO ₂	5-CF ₃	3-Cl
I. 1. 17	苯基	2-NO ₂	5-CF ₃	4-Cl
I. 1. 18	苯基	2-NO ₂	4-CF ₃	5-Cl
I. 1. 19	苯基	2-NO ₂	5-CF ₃	6-Cl
I. 1. 20	苯基	2-NO ₂	5-CF ₃	3-F
I. 1. 21	苯基	2-NO ₂	5-CF ₃	4-F
I. 1. 22	苯基	2-NO ₂	4-CF ₃	5-F
I. 1. 23	苯基	2-NO ₂	5-CF ₃	6-F
I. 1. 24	苯基	2-NO ₂	5-CF ₃	3-CH ₃
I. 1. 25	苯基	2-NO ₂	5-CF ₃	4-CH ₃
I. 1. 26	苯基	2-NO ₂	4-CF ₃	5-CH ₃
I. 1. 27	苯基	2-NO ₂	5-CF ₃	6-CH ₃
I. 1. 28	苯基	2-NO ₂	4-CF ₃	5- 乙烯基
I. 1. 29	苯基	2-NO ₂	4-CF ₃	6- 乙烯基

I. 1. 30	苯基	2-NO ₂	3-Cl	4-F
I. 1. 31	苯基	2-NO ₂	3-Cl	5-F
I. 1. 32	苯基	2-NO ₂	3-Cl	6-F
I. 1. 33	苯基	2-NO ₂	3-Cl	4-Cl
I. 1. 34	苯基	2-NO ₂	3-Cl	5-Cl
I. 1. 35	苯基	2-NO ₂	3-Cl	6-Cl
I. 1. 36	苯基	2-NO ₂	3-Cl	4-CH ₃

[0147]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 37	苯基	2-NO ₂	3-Cl	5-CH ₃
I. 1. 38	苯基	2-NO ₂	3-Cl	6-CH ₃
I. 1. 39	苯基	2-NO ₂	3-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 40	苯基	2-NO ₂	3-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 41	苯基	2-NO ₂	3-F	4-F
I. 1. 42	苯基	2-NO ₂	3-F	5-F
I. 1. 43	苯基	2-NO ₂	3-F	6-F
I. 1. 44	苯基	2-NO ₂	3-F	4-Cl
I. 1. 45	苯基	2-NO ₂	3-F	5-Cl
I. 1. 46	苯基	2-NO ₂	3-F	6-Cl
I. 1. 47	苯基	2-NO ₂	3-F	4-CH ₃
I. 1. 48	苯基	2-NO ₂	3-F	5-CH ₃
I. 1. 49	苯基	2-NO ₂	3-F	6-CH ₃
I. 1. 50	苯基	2-NO ₂	3-F	5- 乙烯基
I. 1. 51	苯基	2-NO ₂	3-F	6- 乙烯基

I. 1. 52	苯基	2-NO ₂	3-CH ₃	4-F
I. 1. 53	苯基	2-NO ₂	3-CH ₃	5-F
I. 1. 54	苯基	2-NO ₂	3-CH ₃	6-F
I. 1. 55	苯基	2-NO ₂	3-CH ₃	4-Cl
I. 1. 56	苯基	2-NO ₂	3-CH ₃	5-Cl
I. 1. 57	苯基	2-NO ₂	3-CH ₃	6-Cl
I. 1. 58	苯基	2-NO ₂	3-CH ₃	4-CH ₃
I. 1. 59	苯基	2-NO ₂	3-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 60	苯基	2-NO ₂	3-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 61	苯基	2-NO ₂	3-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 62	苯基	2-NO ₂	3-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 63	苯基	2-NO ₂	4-Cl	5-F
I. 1. 64	苯基	2-NO ₂	4-Cl	6-F
I. 1. 65	苯基	2-NO ₂	4-Cl	5-Cl
I. 1. 66	苯基	2-NO ₂	4-Cl	6-Cl
I. 1. 67	苯基	2-NO ₂	4-Cl	5-CH ₃
I. 1. 68	苯基	2-NO ₂	4-Cl	6-CH ₃
I. 1. 69	苯基	2-NO ₂	4-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 70	苯基	2-NO ₂	4-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 71	苯基	2-NO ₂	4-F	5-F
I. 1. 72	苯基	2-NO ₂	4-F	6-F

[0148]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 73	苯基	2-NO ₂	4-F	5-Cl

I. 1. 74	苯基	2-NO ₂	4-F	6-Cl
I. 1. 75	苯基	2-NO ₂	4-F	5-CH ₃
I. 1. 76	苯基	2-NO ₂	4-F	6-CH ₃
I. 1. 77	苯基	2-NO ₂	4-F	5- 乙烯基
I. 1. 78	苯基	2-NO ₂	4-F	6- 乙烯基
I. 1. 79	苯基	2-NO ₂	4-CH ₃	5-F
I. 1. 80	苯基	2-NO ₂	4-CH ₃	6-F
I. 1. 81	苯基	2-NO ₂	4-CH ₃	5-Cl
I. 1. 82	苯基	2-NO ₂	4-CH ₃	6-Cl
I. 1. 83	苯基	2-NO ₂	4-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 84	苯基	2-NO ₂	4-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 85	苯基	2-NO ₂	4-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 86	苯基	2-NO ₂	4-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 87	苯基	2-NO ₂	5-Cl	6-Cl
I. 1. 88	苯基	2-NO ₂	5-Cl	6-F
I. 1. 89	苯基	2-NO ₂	5-Cl	6-CH ₃
I. 1. 90	苯基	2-NO ₂	5-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 91	苯基	2-NO ₂	5-F	6-Cl
I. 1. 92	苯基	2-NO ₂	5-F	6-F
I. 1. 93	苯基	2-NO ₂	5-F	6-CH ₃
I. 1. 94	苯基	2-NO ₂	5-F	6- 乙烯基
I. 1. 95	苯基	2-NO ₂	5-CH ₃	6-Cl
I. 1. 96	苯基	2-NO ₂	5-CH ₃	6-F
I. 1. 97	苯基	2-NO ₂	5-CH ₃	6-CH ₃

I. 1. 98	苯基	2-NO ₂	5-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 99	苯基	2-NO ₂	5- 乙烯基	6-Cl
I. 1. 100	苯基	2-NO ₂	5- 乙烯基	6-F
I. 1. 101	苯基	2-NO ₂	5- 乙烯基	6-CH ₃
I. 1. 102	苯基	2-NO ₂	5- 乙烯基	6- 乙烯基
I. 1. 103	苯基	2-CN	H	H
I. 1. 104	苯基	2-CN	3-Cl	H
I. 1. 105	苯基	2-CN	4-Cl	H
I. 1. 106	苯基	2-CN	5-Cl	H
I. 1. 107	苯基	2-CN	6-Cl	H
I. 1. 108	苯基	2-CN	3-F	H

[0149]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 109	苯基	2-CN	4-F	H
I. 1. 110	苯基	2-CN	5-F	H
I. 1. 111	苯基	2-CN	6-F	H
I. 1. 112	苯基	2-CN	3-CH ₃	H
I. 1. 113	苯基	2-CN	4-CH ₃	H
I. 1. 114	苯基	2-CN	5-CH ₃	H
I. 1. 115	苯基	2-CN	6-CH ₃	H
I. 1. 116	苯基	2-CN	5- 乙烯基	H
I. 1. 117	苯基	2-CN	6- 乙烯基	H
I. 1. 118	苯基	2-CN	5-CF ₃	3-Cl
I. 1. 119	苯基	2-CN	5-CF ₃	4-Cl

I. 1. 120	苯基	2-CN	4-CF ₃	5-Cl
I. 1. 121	苯基	2-CN	5-CF ₃	6-Cl
I. 1. 122	苯基	2-CN	5-CF ₃	3-F
I. 1. 123	苯基	2-CN	5-CF ₃	4-F
I. 1. 124	苯基	2-CN	4-CF ₃	5-F
I. 1. 125	苯基	2-CN	5-CF ₃	6-F
I. 1. 126	苯基	2-CN	5-CF ₃	3-CH ₃
I. 1. 127	苯基	2-CN	5-CF ₃	4-CH ₃
I. 1. 128	苯基	2-CN	4-CF ₃	5-CH ₃
I. 1. 129	苯基	2-CN	5-CF ₃	6-CH ₃
I. 1. 130	苯基	2-CN	4-CF ₃	5- 乙烯基
I. 1. 131	苯基	2-CN	4-CF ₃	6- 乙烯基
I. 1. 132	苯基	2-CN	3-Cl	4-F
I. 1. 133	苯基	2-CN	3-Cl	5-F
I. 1. 134	苯基	2-CN	3-Cl	6-F
I. 1. 135	苯基	2-CN	3-Cl	4-Cl
I. 1. 136	苯基	2-CN	3-Cl	5-Cl
I. 1. 137	苯基	2-CN	3-Cl	6-Cl
I. 1. 138	苯基	2-CN	3-Cl	4-CH ₃
I. 1. 139	苯基	2-CN	3-Cl	5-CH ₃
I. 1. 140	苯基	2-CN	3-Cl	6-CH ₃
I. 1. 141	苯基	2-CN	3-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 142	苯基	2-CN	3-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 143	苯基	2-CN	3-F	4-F

I. 1. 144	苯基	2-CN	3-F	5-F
-----------	----	------	-----	-----

[0150]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 145	苯基	2-CN	3-F	6-F
I. 1. 146	苯基	2-CN	3-F	4-Cl
I. 1. 147	苯基	2-CN	3-F	5-Cl
I. 1. 148	苯基	2-CN	3-F	6-Cl
I. 1. 149	苯基	2-CN	3-F	4-CH ₃
I. 1. 150	苯基	2-CN	3-F	5-CH ₃
I. 1. 151	苯基	2-CN	3-F	6-CH ₃
I. 1. 152	苯基	2-CN	3-F	5- 乙烯基
I. 1. 153	苯基	2-CN	3-F	6- 乙烯基
I. 1. 154	苯基	2-CN	3-CH ₃	4-F
I. 1. 155	苯基	2-CN	3-CH ₃	5-F
I. 1. 156	苯基	2-CN	3-CH ₃	6-F
I. 1. 157	苯基	2-CN	3-CH ₃	4-Cl
I. 1. 158	苯基	2-CN	3-CH ₃	5-Cl
I. 1. 159	苯基	2-CN	3-CH ₃	6-Cl
I. 1. 160	苯基	2-CN	3-CH ₃	4-CH ₃
I. 1. 161	苯基	2-CN	3-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 162	苯基	2-CN	3-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 163	苯基	2-CN	3-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 164	苯基	2-CN	3-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 165	苯基	2-CN	4-Cl	5-F

I. 1. 166	苯基	2-CN	4-Cl	6-F
I. 1. 167	苯基	2-CN	4-Cl	5-Cl
I. 1. 168	苯基	2-CN	4-Cl	6-Cl
I. 1. 169	苯基	2-CN	4-Cl	5-CH ₃
I. 1. 170	苯基	2-CN	4-Cl	6-CH ₃
I. 1. 171	苯基	2-CN	4-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 172	苯基	2-CN	4-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 173	苯基	2-CN	4-F	5-F
I. 1. 174	苯基	2-CN	4-F	6-F
I. 1. 175	苯基	2-CN	4-F	5-Cl
I. 1. 176	苯基	2-CN	4-F	6-Cl
I. 1. 177	苯基	2-CN	4-F	5-CH ₃
I. 1. 178	苯基	2-CN	4-F	6-CH ₃
I. 1. 179	苯基	2-CN	4-F	5- 乙烯基
I. 1. 180	苯基	2-CN	4-F	6- 乙烯基

[0151]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 181	苯基	2-CN	4-CH ₃	5-F
I. 1. 182	苯基	2-CN	4-CH ₃	6-F
I. 1. 183	苯基	2-CN	4-CH ₃	5-Cl
I. 1. 184	苯基	2-CN	4-CH ₃	6-Cl
I. 1. 185	苯基	2-CN	4-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 186	苯基	2-CN	4-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 187	苯基	2-CN	4-CH ₃	5- 乙烯基

I. 1. 188	苯基	2-CN	4-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 189	苯基	2-CN	5-Cl	6-Cl
I. 1. 190	苯基	2-CN	5-Cl	6-F
I. 1. 191	苯基	2-CN	5-Cl	6-CH ₃
I. 1. 192	苯基	2-CN	5-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 193	苯基	2-CN	5-F	6-Cl
I. 1. 194	苯基	2-CN	5-F	6-F
I. 1. 195	苯基	2-CN	5-F	6-CH ₃
I. 1. 196	苯基	2-CN	5-F	6- 乙烯基
I. 1. 197	苯基	2-CN	5-CH ₃	6-Cl
I. 1. 198	苯基	2-CN	5-CH ₃	6-F
I. 1. 199	苯基	2-CN	5-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 200	苯基	2-CN	5-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 201	苯基	2-CN	5- 乙烯基	6-Cl
I. 1. 202	苯基	2-CN	5- 乙烯基	6-F
I. 1. 203	苯基	2-CN	5- 乙烯基	6-CH ₃
I. 1. 204	苯基	2-CN	5- 乙烯基	6- 乙烯基
I. 1. 205	苯基	2- 乙炔基	H	H
I. 1. 206	苯基	2- 乙炔基	3-Cl	H
I. 1. 207	苯基	2- 乙炔基	4-Cl	H
I. 1. 208	苯基	2- 乙炔基	5-Cl	H
I. 1. 209	苯基	2- 乙炔基	6-Cl	H
I. 1. 210	苯基	2- 乙炔基	3-F	H
I. 1. 211	苯基	2- 乙炔基	4-F	H

I. 1. 212	苯基	2- 乙炔基	5-F	H
I. 1. 213	苯基	2- 乙炔基	6-F	H
I. 1. 214	苯基	2- 乙炔基	3-CH ₃	H
I. 1. 215	苯基	2- 乙炔基	4-CH ₃	H
I. 1. 216	苯基	2- 乙炔基	5-CH ₃	H

[0152]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 217	苯基	2- 乙炔基	6-CH ₃	H
I. 1. 218	苯基	2- 乙炔基	5- 乙烯基	H
I. 1. 219	苯基	2- 乙炔基	6- 乙烯基	H
I. 1. 220	苯基	2- 乙炔基	5-CF ₃	3-Cl
I. 1. 221	苯基	2- 乙炔基	5-CF ₃	4-Cl
I. 1. 222	苯基	2- 乙炔基	4-CF ₃	5-Cl
I. 1. 223	苯基	2- 乙炔基	5-CF ₃	6-Cl
I. 1. 224	苯基	2- 乙炔基	5-CF ₃	3-F
I. 1. 225	苯基	2- 乙炔基	5-CF ₃	4-F
I. 1. 226	苯基	2- 乙炔基	4-CF ₃	5-F
I. 1. 227	苯基	2- 乙炔基	5-CF ₃	6-F
I. 1. 228	苯基	2- 乙炔基	5-CF ₃	3-CH ₃
I. 1. 229	苯基	2- 乙炔基	5-CF ₃	4-CH ₃
I. 1. 230	苯基	2- 乙炔基	4-CF ₃	5-CH ₃
I. 1. 231	苯基	2- 乙炔基	5-CF ₃	6-CH ₃
I. 1. 232	苯基	2- 乙炔基	4-CF ₃	5- 乙烯基
I. 1. 233	苯基	2- 乙炔基	4-CF ₃	6- 乙烯基

I. 1. 234	苯基	2- 乙炔基	3-Cl	4-F
I. 1. 235	苯基	2- 乙炔基	3-Cl	5-F
I. 1. 236	苯基	2- 乙炔基	3-Cl	6-F
I. 1. 237	苯基	2- 乙炔基	3-Cl	4-Cl
I. 1. 238	苯基	2- 乙炔基	3-Cl	5-Cl
I. 1. 239	苯基	2- 乙炔基	3-Cl	6-Cl
I. 1. 240	苯基	2- 乙炔基	3-Cl	4-CH ₃
I. 1. 241	苯基	2- 乙炔基	3-Cl	5-CH ₃
I. 1. 242	苯基	2- 乙炔基	3-Cl	6-CH ₃
I. 1. 243	苯基	2- 乙炔基	3-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 244	苯基	2- 乙炔基	3-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 245	苯基	2- 乙炔基	3-F	4-F
I. 1. 246	苯基	2- 乙炔基	3-F	5-F
I. 1. 247	苯基	2- 乙炔基	3-F	6-F
I. 1. 248	苯基	2- 乙炔基	3-F	4-Cl
I. 1. 249	苯基	2- 乙炔基	3-F	5-Cl
I. 1. 250	苯基	2- 乙炔基	3-F	6-Cl
I. 1. 251	苯基	2- 乙炔基	3-F	4-CH ₃
I. 1. 252	苯基	2- 乙炔基	3-F	5-CH ₃

[0153]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 253	苯基	2- 乙炔基	3-F	6-CH ₃
I. 1. 254	苯基	2- 乙炔基	3-F	5- 乙烯基
I. 1. 255	苯基	2- 乙炔基	3-F	6- 乙烯基

I. 1. 256	苯基	2- 乙炔基	3-CH ₃	4-F
I. 1. 257	苯基	2- 乙炔基	3-CH ₃	5-F
I. 1. 258	苯基	2- 乙炔基	3-CH ₃	6-F
I. 1. 259	苯基	2- 乙炔基	3-CH ₃	4-Cl
I. 1. 260	苯基	2- 乙炔基	3-CH ₃	5-Cl
I. 1. 261	苯基	2- 乙炔基	3-CH ₃	6-Cl
I. 1. 262	苯基	2- 乙炔基	3-CH ₃	4-CH ₃
I. 1. 263	苯基	2- 乙炔基	3-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 264	苯基	2- 乙炔基	3-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 265	苯基	2- 乙炔基	3-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 266	苯基	2- 乙炔基	3-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 267	苯基	2- 乙炔基	4-Cl	5-F
I. 1. 268	苯基	2- 乙炔基	4-Cl	6-F
I. 1. 269	苯基	2- 乙炔基	4-Cl	5-Cl
I. 1. 270	苯基	2- 乙炔基	4-Cl	6-Cl
I. 1. 271	苯基	2- 乙炔基	4-Cl	5-CH ₃
I. 1. 272	苯基	2- 乙炔基	4-Cl	6-CH ₃
I. 1. 273	苯基	2- 乙炔基	4-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 274	苯基	2- 乙炔基	4-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 275	苯基	2- 乙炔基	4-F	5-F
I. 1. 276	苯基	2- 乙炔基	4-F	6-F
I. 1. 277	苯基	2- 乙炔基	4-F	5-Cl
I. 1. 278	苯基	2- 乙炔基	4-F	6-Cl
I. 1. 279	苯基	2- 乙炔基	4-F	5-CH ₃

I. 1. 280	苯基	2- 乙炔基	4-F	6-CH ₃
I. 1. 281	苯基	2- 乙炔基	4-F	5- 乙烯基
I. 1. 282	苯基	2- 乙炔基	4-F	6- 乙烯基
I. 1. 283	苯基	2- 乙炔基	4-CH ₃	5-F
I. 1. 284	苯基	2- 乙炔基	4-CH ₃	6-F
I. 1. 285	苯基	2- 乙炔基	4-CH ₃	5-Cl
I. 1. 286	苯基	2- 乙炔基	4-CH ₃	6-Cl
I. 1. 287	苯基	2- 乙炔基	4-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 288	苯基	2- 乙炔基	4-CH ₃	6-CH ₃

[0154]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 289	苯基	2- 乙炔基	4-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 290	苯基	2- 乙炔基	4-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 291	苯基	2- 乙炔基	5-Cl	6-Cl
I. 1. 292	苯基	2- 乙炔基	5-Cl	6-F
I. 1. 293	苯基	2- 乙炔基	5-Cl	6-CH ₃
I. 1. 294	苯基	2- 乙炔基	5-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 295	苯基	2- 乙炔基	5-F	6-Cl
I. 1. 296	苯基	2- 乙炔基	5-F	6-F
I. 1. 297	苯基	2- 乙炔基	5-F	6-CH ₃
I. 1. 298	苯基	2- 乙炔基	5-F	6- 乙烯基
I. 1. 299	苯基	2- 乙炔基	5-CH ₃	6-Cl
I. 1. 300	苯基	2- 乙炔基	5-CH ₃	6-F
I. 1. 301	苯基	2- 乙炔基	5-CH ₃	6-CH ₃

I. 1. 302	苯基	2- 乙炔基	5-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 303	苯基	2- 乙炔基	5- 乙烯基	6-Cl
I. 1. 304	苯基	2- 乙炔基	5- 乙烯基	6-F
I. 1. 305	苯基	2- 乙炔基	5- 乙烯基	6-CH ₃
I. 1. 306	苯基	2- 乙炔基	5- 乙烯基	6- 乙烯基
I. 1. 307	苯基	2-COOCH ₃	H	H
I. 1. 308	苯基	2-COOCH ₃	3-Cl	H
I. 1. 309	苯基	2-COOCH ₃	4-Cl	H
I. 1. 310	苯基	2-COOCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 311	苯基	2-COOCH ₃	6-Cl	H
I. 1. 312	苯基	2-COOCH ₃	3-F	H
I. 1. 313	苯基	2-COOCH ₃	4-F	H
I. 1. 314	苯基	2-COOCH ₃	5-F	H
I. 1. 315	苯基	2-COOCH ₃	6-F	H
I. 1. 316	苯基	2-COOCH ₃	3-CH ₃	H
I. 1. 317	苯基	2-COOCH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 318	苯基	2-COOCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 319	苯基	2-COOCH ₃	6-CH ₃	H
I. 1. 320	苯基	2-COOCH ₃	5- 乙烯基	H
I. 1. 321	苯基	2-COOCH ₃	6- 乙烯基	H
I. 1. 322	苯基	2-COOCH ₃	5-CF ₃	3-Cl
I. 1. 323	苯基	2-COOCH ₃	5-CF ₃	4-Cl
I. 1. 324	苯基	2-COOCH ₃	4-CF ₃	5-Cl

[0155]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 325	苯基	2-COOCH ₃	5-CF ₃	6-Cl
I. 1. 326	苯基	2-COOCH ₃	5-CF ₃	3-F
I. 1. 327	苯基	2-COOCH ₃	5-CF ₃	4-F
I. 1. 328	苯基	2-COOCH ₃	4-CF ₃	5-F
I. 1. 329	苯基	2-COOCH ₃	5-CF ₃	6-F
I. 1. 330	苯基	2-COOCH ₃	5-CF ₃	3-CH ₃
I. 1. 331	苯基	2-COOCH ₃	5-CF ₃	4-CH ₃
I. 1. 332	苯基	2-COOCH ₃	4-CF ₃	5-CH ₃
I. 1. 333	苯基	2-COOCH ₃	5-CF ₃	6-CH ₃
I. 1. 334	苯基	2-COOCH ₃	4-CF ₃	5- 乙烯基
I. 1. 335	苯基	2-COOCH ₃	4-CF ₃	6- 乙烯基
I. 1. 336	苯基	2-COOCH ₃	3-Cl	4-F
I. 1. 337	苯基	2-COOCH ₃	3-Cl	5-F
I. 1. 338	苯基	2-COOCH ₃	3-Cl	6-F
I. 1. 339	苯基	2-COOCH ₃	3-Cl	4-Cl
I. 1. 340	苯基	2-COOCH ₃	3-Cl	5-Cl
I. 1. 341	苯基	2-COOCH ₃	3-Cl	6-Cl
I. 1. 342	苯基	2-COOCH ₃	3-Cl	4-CH ₃
I. 1. 343	苯基	2-COOCH ₃	3-Cl	5-CH ₃
I. 1. 344	苯基	2-COOCH ₃	3-Cl	6-CH ₃
I. 1. 345	苯基	2-COOCH ₃	3-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 346	苯基	2-COOCH ₃	3-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 347	苯基	2-COOCH ₃	3-F	4-F

I. 1. 348	苯基	2-COOCH ₃	3-F	5-F
I. 1. 349	苯基	2-COOCH ₃	3-F	6-F
I. 1. 350	苯基	2-COOCH ₃	3-F	4-Cl
I. 1. 351	苯基	2-COOCH ₃	3-F	5-Cl
I. 1. 352	苯基	2-COOCH ₃	3-F	6-Cl
I. 1. 353	苯基	2-COOCH ₃	3-F	4-CH ₃
I. 1. 354	苯基	2-COOCH ₃	3-F	5-CH ₃
I. 1. 355	苯基	2-COOCH ₃	3-F	6-CH ₃
I. 1. 356	苯基	2-COOCH ₃	3-F	5- 乙烯基
I. 1. 357	苯基	2-COOCH ₃	3-F	6- 乙烯基
I. 1. 358	苯基	2-COOCH ₃	3-CH ₃	4-F
I. 1. 359	苯基	2-COOCH ₃	3-CH ₃	5-F
I. 1. 360	苯基	2-COOCH ₃	3-CH ₃	6-F

[0156]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 361	苯基	2-COOCH ₃	3-CH ₃	4-Cl
I. 1. 362	苯基	2-COOCH ₃	3-CH ₃	5-Cl
I. 1. 363	苯基	2-COOCH ₃	3-CH ₃	6-Cl
I. 1. 364	苯基	2-COOCH ₃	3-CH ₃	4-CH ₃
I. 1. 365	苯基	2-COOCH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 366	苯基	2-COOCH ₃	3-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 367	苯基	2-COOCH ₃	3-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 368	苯基	2-COOCH ₃	3-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 369	苯基	2-COOCH ₃	4-Cl	5-F

I. 1. 370	苯基	2-COOCH ₃	4-Cl	6-F
I. 1. 371	苯基	2-COOCH ₃	4-Cl	5-Cl
I. 1. 372	苯基	2-COOCH ₃	4-Cl	6-Cl
I. 1. 373	苯基	2-COOCH ₃	4-Cl	5-CH ₃
I. 1. 374	苯基	2-COOCH ₃	4-Cl	6-CH ₃
I. 1. 375	苯基	2-COOCH ₃	4-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 376	苯基	2-COOCH ₃	4-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 377	苯基	2-COOCH ₃	4-F	5-F
I. 1. 378	苯基	2-COOCH ₃	4-F	6-F
I. 1. 379	苯基	2-COOCH ₃	4-F	5-Cl
I. 1. 380	苯基	2-COOCH ₃	4-F	6-Cl
I. 1. 381	苯基	2-COOCH ₃	4-F	5-CH ₃
I. 1. 382	苯基	2-COOCH ₃	4-F	6-CH ₃
I. 1. 383	苯基	2-COOCH ₃	4-F	5- 乙烯基
I. 1. 384	苯基	2-COOCH ₃	4-F	6- 乙烯基
I. 1. 385	苯基	2-COOCH ₃	4-CH ₃	5-F
I. 1. 386	苯基	2-COOCH ₃	4-CH ₃	6-F
I. 1. 387	苯基	2-COOCH ₃	4-CH ₃	5-Cl
I. 1. 388	苯基	2-COOCH ₃	4-CH ₃	6-Cl
I. 1. 389	苯基	2-COOCH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 390	苯基	2-COOCH ₃	4-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 391	苯基	2-COOCH ₃	4-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 392	苯基	2-COOCH ₃	4-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 393	苯基	2-COOCH ₃	5-Cl	6-Cl

I. 1. 394	苯基	2-COOCH ₃	5-Cl	6-F
I. 1. 395	苯基	2-COOCH ₃	5-Cl	6-CH ₃
I. 1. 396	苯基	2-COOCH ₃	5-Cl	6- 乙烯基

[0157]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 397	苯基	2-COOCH ₃	5-F	6-Cl
I. 1. 398	苯基	2-COOCH ₃	5-F	6-F
I. 1. 399	苯基	2-COOCH ₃	5-F	6-CH ₃
I. 1. 400	苯基	2-COOCH ₃	5-F	6- 乙烯基
I. 1. 401	苯基	2-COOCH ₃	5-CH ₃	6-Cl
I. 1. 402	苯基	2-COOCH ₃	5-CH ₃	6-F
I. 1. 403	苯基	2-COOCH ₃	5-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 404	苯基	2-COOCH ₃	5-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 405	苯基	2-COOCH ₃	5- 乙烯基	6-Cl
I. 1. 406	苯基	2-COOCH ₃	5- 乙烯基	6-F
I. 1. 407	苯基	2-COOCH ₃	5- 乙烯基	6-CH ₃
I. 1. 408	苯基	2-COOCH ₃	5- 乙烯基	6- 乙烯基
I. 1. 409	苯基	2-COOH	H	H
I. 1. 410	苯基	2-COOH	3-Cl	H
I. 1. 411	苯基	2-COOH	4-Cl	H
I. 1. 412	苯基	2-COOH	5-Cl	H
I. 1. 413	苯基	2-COOH	6-Cl	H
I. 1. 414	苯基	2-COOH	3-F	H
I. 1. 415	苯基	2-COOH	4-F	H

I. 1. 416	苯基	2-COOH	5-F	H
I. 1. 417	苯基	2-COOH	6-F	H
I. 1. 418	苯基	2-COOH	3-CH ₃	H
I. 1. 419	苯基	2-COOH	4-CH ₃	H
I. 1. 420	苯基	2-COOH	5-CH ₃	H
I. 1. 421	苯基	2-COOH	6-CH ₃	H
I. 1. 422	苯基	2-COOH	5- 乙烯基	H
I. 1. 423	苯基	2-COOH	6- 乙烯基	H
I. 1. 424	苯基	2-COOH	5-CF ₃	3-Cl
I. 1. 425	苯基	2-COOH	5-CF ₃	4-Cl
I. 1. 426	苯基	2-COOH	4-CF ₃	5-Cl
I. 1. 427	苯基	2-COOH	5-CF ₃	6-Cl
I. 1. 428	苯基	2-COOH	5-CF ₃	3-F
I. 1. 429	苯基	2-COOH	5-CF ₃	4-F
I. 1. 430	苯基	2-COOH	4-CF ₃	5-F
I. 1. 431	苯基	2-COOH	5-CF ₃	6-F
I. 1. 432	苯基	2-COOH	5-CF ₃	3-CH ₃

[0158]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 433	苯基	2-COOH	5-CF ₃	4-CH ₃
I. 1. 434	苯基	2-COOH	4-CF ₃	5-CH ₃
I. 1. 435	苯基	2-COOH	5-CF ₃	6-CH ₃
I. 1. 436	苯基	2-COOH	4-CF ₃	5- 乙烯基
I. 1. 437	苯基	2-COOH	4-CF ₃	6- 乙烯基

I. 1. 438	苯基	2-COOH	3-Cl	4-F
I. 1. 439	苯基	2-COOH	3-Cl	5-F
I. 1. 440	苯基	2-COOH	3-Cl	6-F
I. 1. 441	苯基	2-COOH	3-Cl	4-Cl
I. 1. 442	苯基	2-COOH	3-Cl	5-Cl
I. 1. 443	苯基	2-COOH	3-Cl	6-Cl
I. 1. 444	苯基	2-COOH	3-Cl	4-CH ₃
I. 1. 445	苯基	2-COOH	3-Cl	5-CH ₃
I. 1. 446	苯基	2-COOH	3-Cl	6-CH ₃
I. 1. 447	苯基	2-COOH	3-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 448	苯基	2-COOH	3-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 449	苯基	2-COOH	3-F	4-F
I. 1. 450	苯基	2-COOH	3-F	5-F
I. 1. 451	苯基	2-COOH	3-F	6-F
I. 1. 452	苯基	2-COOH	3-F	4-Cl
I. 1. 453	苯基	2-COOH	3-F	5-Cl
I. 1. 454	苯基	2-COOH	3-F	6-Cl
I. 1. 455	苯基	2-COOH	3-F	4-CH ₃
I. 1. 456	苯基	2-COOH	3-F	5-CH ₃
I. 1. 457	苯基	2-COOH	3-F	6-CH ₃
I. 1. 458	苯基	2-COOH	3-F	5- 乙烯基
I. 1. 459	苯基	2-COOH	3-F	6- 乙烯基
I. 1. 460	苯基	2-COOH	3-CH ₃	4-F
I. 1. 461	苯基	2-COOH	3-CH ₃	5-F

I. 1. 462	苯基	2-COOH	3-CH ₃	6-F
I. 1. 463	苯基	2-COOH	3-CH ₃	4-Cl
I. 1. 464	苯基	2-COOH	3-CH ₃	5-Cl
I. 1. 465	苯基	2-COOH	3-CH ₃	6-Cl
I. 1. 466	苯基	2-COOH	3-CH ₃	4-CH ₃
I. 1. 467	苯基	2-COOH	3-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 468	苯基	2-COOH	3-CH ₃	6-CH ₃

[0159]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 469	苯基	2-COOH	3-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 470	苯基	2-COOH	3-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 471	苯基	2-COOH	4-Cl	5-F
I. 1. 472	苯基	2-COOH	4-Cl	6-F
I. 1. 473	苯基	2-COOH	4-Cl	5-Cl
I. 1. 474	苯基	2-COOH	4-Cl	6-Cl
I. 1. 475	苯基	2-COOH	4-Cl	5-CH ₃
I. 1. 476	苯基	2-COOH	4-Cl	6-CH ₃
I. 1. 477	苯基	2-COOH	4-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 478	苯基	2-COOH	4-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 479	苯基	2-COOH	4-F	5-F
I. 1. 480	苯基	2-COOH	4-F	6-F
I. 1. 481	苯基	2-COOH	4-F	5-Cl
I. 1. 482	苯基	2-COOH	4-F	6-Cl
I. 1. 483	苯基	2-COOH	4-F	5-CH ₃

I. 1. 484	苯基	2-COOH	4-F	6-CH ₃
I. 1. 485	苯基	2-COOH	4-F	5- 乙烯基
I. 1. 486	苯基	2-COOH	4-F	6- 乙烯基
I. 1. 487	苯基	2-COOH	4-CH ₃	5-F
I. 1. 488	苯基	2-COOH	4-CH ₃	6-F
I. 1. 489	苯基	2-COOH	4-CH ₃	5-Cl
I. 1. 490	苯基	2-COOH	4-CH ₃	6-Cl
I. 1. 491	苯基	2-COOH	4-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 492	苯基	2-COOH	4-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 493	苯基	2-COOH	4-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 494	苯基	2-COOH	4-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 495	苯基	2-COOH	5-Cl	6-Cl
I. 1. 496	苯基	2-COOH	5-Cl	6-F
I. 1. 497	苯基	2-COOH	5-Cl	6-CH ₃
I. 1. 498	苯基	2-COOH	5-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 499	苯基	2-COOH	5-F	6-Cl
I. 1. 500	苯基	2-COOH	5-F	6-F
I. 1. 501	苯基	2-COOH	5-F	6-CH ₃
I. 1. 502	苯基	2-COOH	5-F	6- 乙烯基
I. 1. 503	苯基	2-COOH	5-CH ₃	6-Cl
I. 1. 504	苯基	2-COOH	5-CH ₃	6-F

[0160]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 505	苯基	2-COOH	5-CH ₃	6-CH ₃

I. 1. 506	苯基	2-COOH	5-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 507	苯基	2-COOH	5- 乙烯基	6-Cl
I. 1. 508	苯基	2-COOH	5- 乙烯基	6-F
I. 1. 509	苯基	2-COOH	5- 乙烯基	6-CH ₃
I. 1. 510	苯基	2-COOH	5- 乙烯基	6- 乙烯基
I. 1. 511	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	H	H
I. 1. 512	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	3-Cl	H
I. 1. 513	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	4-Cl	H
I. 1. 514	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	H
I. 1. 515	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	6-Cl	H
I. 1. 516	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	3-F	H
I. 1. 517	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	4-F	H
I. 1. 518	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	5-F	H
I. 1. 519	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	6-F	H
I. 1. 520	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	3-CH ₃	H
I. 1. 521	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	4-CH ₃	H
I. 1. 522	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 523	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	6-CH ₃	H
I. 1. 524	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	5- 乙烯基	H
I. 1. 525	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	6- 乙烯基	H
I. 1. 526	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	3-Cl
I. 1. 527	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	4-Cl
I. 1. 528	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	4-CF ₃	5-Cl
I. 1. 529	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	6-Cl

I. 1. 530	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	3-F
I. 1. 531	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	4-F
I. 1. 532	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	4-CF ₃	5-F
I. 1. 533	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	6-F
I. 1. 534	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	3-CH ₃
I. 1. 535	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	4-CH ₃
I. 1. 536	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	4-CF ₃	5-CH ₃
I. 1. 537	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	6-CH ₃
I. 1. 538	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	4-CF ₃	5- 乙烯基
I. 1. 539	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	4-CF ₃	6- 乙烯基
I. 1. 540	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	3-Cl	4-F

[0161]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 541	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	3-Cl	5-F
I. 1. 542	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	3-Cl	6-F
I. 1. 543	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	3-Cl	4-Cl
I. 1. 544	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	3-Cl	5-Cl
I. 1. 545	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	3-Cl	6-Cl
I. 1. 546	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	3-Cl	4-CH ₃
I. 1. 547	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	3-Cl	5-CH ₃
I. 1. 548	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	3-Cl	6-CH ₃
I. 1. 549	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	3-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 550	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	3-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 551	苯基	2-CON(CH ₃) ₂	3-F	4-F

I. 1. 552	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-F	5-F
I. 1. 553	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-F	6-F
I. 1. 554	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-F	4-Cl
I. 1. 555	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-F	5-Cl
I. 1. 556	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-F	6-Cl
I. 1. 557	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-F	4-CH ₃
I. 1. 558	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-F	5-CH ₃
I. 1. 559	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-F	6-CH ₃
I. 1. 560	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-F	5- 乙烯基
I. 1. 561	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-F	6- 乙烯基
I. 1. 562	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-CH ₃	4-F
I. 1. 563	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-CH ₃	5-F
I. 1. 564	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-CH ₃	6-F
I. 1. 565	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-CH ₃	4-Cl
I. 1. 566	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-CH ₃	5-Cl
I. 1. 567	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-CH ₃	6-Cl
I. 1. 568	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-CH ₃	4-CH ₃
I. 1. 569	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 570	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 571	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 572	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	3-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 573	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-Cl	5-F
I. 1. 574	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-Cl	6-F
I. 1. 575	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-Cl	5-Cl

I. 1. 576	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-Cl	6-Cl
-----------	----	-------------------------------	------	------

[0162]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 577	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-Cl	5-CH ₃
I. 1. 578	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-Cl	6-CH ₃
I. 1. 579	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 580	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 581	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-F	5-F
I. 1. 582	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-F	6-F
I. 1. 583	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-F	5-Cl
I. 1. 584	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-F	6-Cl
I. 1. 585	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-F	5-CH ₃
I. 1. 586	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-F	6-CH ₃
I. 1. 587	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-F	5- 乙烯基
I. 1. 588	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-F	6- 乙烯基
I. 1. 589	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-CH ₃	5-F
I. 1. 590	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-CH ₃	6-F
I. 1. 591	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-CH ₃	5-Cl
I. 1. 592	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-CH ₃	6-Cl
I. 1. 593	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 594	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 595	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 596	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	4-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 597	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-Cl	6-Cl

I. 1. 598	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-Cl	6-F
I. 1. 599	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-Cl	6-CH ₃
I. 1. 600	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 601	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-F	6-Cl
I. 1. 602	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-F	6-F
I. 1. 603	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-F	6-CH ₃
I. 1. 604	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-F	6- 乙烯基
I. 1. 605	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-CH ₃	6-Cl
I. 1. 606	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-CH ₃	6-F
I. 1. 607	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 608	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 609	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5- 乙烯基	6-Cl
I. 1. 610	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5- 乙烯基	6-F
I. 1. 611	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5- 乙烯基	6-CH ₃
I. 1. 612	苯基	$2\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5- 乙烯基	6- 乙烯基

[0163]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 613	苯基	2-I	H	H
I. 1. 614	苯基	2-I	3-Cl	H
I. 1. 615	苯基	2-I	4-Cl	H
I. 1. 616	苯基	2-I	5-Cl	H
I. 1. 617	苯基	2-I	6-Cl	H
I. 1. 618	苯基	2-I	3-F	H
I. 1. 619	苯基	2-I	4-F	H

I. 1. 620	苯基	2-I	5-F	H
I. 1. 621	苯基	2-I	6-F	H
I. 1. 622	苯基	2-I	3-CH ₃	H
I. 1. 623	苯基	2-I	4-CH ₃	H
I. 1. 624	苯基	2-I	5-CH ₃	H
I. 1. 625	苯基	2-I	6-CH ₃	H
I. 1. 626	苯基	2-I	5- 乙烯基	H
I. 1. 627	苯基	2-I	6- 乙烯基	H
I. 1. 628	苯基	2-I	5-CF ₃	3-Cl
I. 1. 629	苯基	2-I	5-CF ₃	4-Cl
I. 1. 630	苯基	2-I	4-CF ₃	5-Cl
I. 1. 631	苯基	2-I	5-CF ₃	6-Cl
I. 1. 632	苯基	2-I	5-CF ₃	3-F
I. 1. 633	苯基	2-I	5-CF ₃	4-F
I. 1. 634	苯基	2-I	4-CF ₃	5-F
I. 1. 635	苯基	2-I	5-CF ₃	6-F
I. 1. 636	苯基	2-I	5-CF ₃	3-CH ₃
I. 1. 637	苯基	2-I	5-CF ₃	4-CH ₃
I. 1. 638	苯基	2-I	4-CF ₃	5-CH ₃
I. 1. 639	苯基	2-I	5-CF ₃	6-CH ₃
I. 1. 640	苯基	2-I	4-CF ₃	5- 乙烯基
I. 1. 641	苯基	2-I	4-CF ₃	6- 乙烯基
I. 1. 642	苯基	2-I	3-Cl	4-F
I. 1. 643	苯基	2-I	3-Cl	5-F

I. 1. 644	苯基	2-I	3-Cl	6-F
I. 1. 645	苯基	2-I	3-Cl	4-Cl
I. 1. 646	苯基	2-I	3-Cl	5-Cl
I. 1. 647	苯基	2-I	3-Cl	6-Cl
I. 1. 648	苯基	2-I	3-Cl	4-CH ₃

[0164]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 649	苯基	2-I	3-Cl	5-CH ₃
I. 1. 650	苯基	2-I	3-Cl	6-CH ₃
I. 1. 651	苯基	2-I	3-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 652	苯基	2-I	3-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 653	苯基	2-I	3-F	4-F
I. 1. 654	苯基	2-I	3-F	5-F
I. 1. 655	苯基	2-I	3-F	6-F
I. 1. 656	苯基	2-I	3-F	4-Cl
I. 1. 657	苯基	2-I	3-F	5-Cl
I. 1. 658	苯基	2-I	3-F	6-Cl
I. 1. 659	苯基	2-I	3-F	4-CH ₃
I. 1. 660	苯基	2-I	3-F	5-CH ₃
I. 1. 661	苯基	2-I	3-F	6-CH ₃
I. 1. 662	苯基	2-I	3-F	5- 乙烯基
I. 1. 663	苯基	2-I	3-F	6- 乙烯基
I. 1. 664	苯基	2-I	3-CH ₃	4-F
I. 1. 665	苯基	2-I	3-CH ₃	5-F

I. 1. 666	苯基	2-I	3-CH ₃	6-F
I. 1. 667	苯基	2-I	3-CH ₃	4-Cl
I. 1. 668	苯基	2-I	3-CH ₃	5-Cl
I. 1. 669	苯基	2-I	3-CH ₃	6-Cl
I. 1. 670	苯基	2-I	3-CH ₃	4-CH ₃
I. 1. 671	苯基	2-I	3-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 672	苯基	2-I	3-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 673	苯基	2-I	3-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 674	苯基	2-I	3-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 675	苯基	2-I	4-Cl	5-F
I. 1. 676	苯基	2-I	4-Cl	6-F
I. 1. 677	苯基	2-I	4-Cl	5-Cl
I. 1. 678	苯基	2-I	4-Cl	6-Cl
I. 1. 679	苯基	2-I	4-Cl	5-CH ₃
I. 1. 680	苯基	2-I	4-Cl	6-CH ₃
I. 1. 681	苯基	2-I	4-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 682	苯基	2-I	4-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 683	苯基	2-I	4-F	5-F
I. 1. 684	苯基	2-I	4-F	6-F

[0165]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 685	苯基	2-I	4-F	5-Cl
I. 1. 686	苯基	2-I	4-F	6-Cl
I. 1. 687	苯基	2-I	4-F	5-CH ₃

I. 1. 688	苯基	2-I	4-F	6-CH ₃
I. 1. 689	苯基	2-I	4-F	5- 乙烯基
I. 1. 690	苯基	2-I	4-F	6- 乙烯基
I. 1. 691	苯基	2-I	4-CH ₃	5-F
I. 1. 692	苯基	2-I	4-CH ₃	6-F
I. 1. 693	苯基	2-I	4-CH ₃	5-Cl
I. 1. 694	苯基	2-I	4-CH ₃	6-Cl
I. 1. 695	苯基	2-I	4-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 696	苯基	2-I	4-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 697	苯基	2-I	4-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 698	苯基	2-I	4-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 699	苯基	2-I	5-Cl	6-Cl
I. 1. 700	苯基	2-I	5-Cl	6-F
I. 1. 701	苯基	2-I	5-Cl	6-CH ₃
I. 1. 702	苯基	2-I	5-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 703	苯基	2-I	5-F	6-Cl
I. 1. 704	苯基	2-I	5-F	6-F
I. 1. 705	苯基	2-I	5-F	6-CH ₃
I. 1. 706	苯基	2-I	5-F	6- 乙烯基
I. 1. 707	苯基	2-I	5-CH ₃	6-Cl
I. 1. 708	苯基	2-I	5-CH ₃	6-F
I. 1. 709	苯基	2-I	5-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 710	苯基	2-I	5-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 711	苯基	2-I	5- 乙烯基	6-Cl

I. 1. 712	苯基	2-I	5- 乙烯基	6-F
I. 1. 713	苯基	2-I	5- 乙烯基	6-CH ₃
I. 1. 714	苯基	2-I	5- 乙烯基	6- 乙烯基
I. 1. 715	苯基	2-Br	H	H
I. 1. 716	苯基	2-Br	3-Cl	H
I. 1. 717	苯基	2-Br	4-Cl	H
I. 1. 718	苯基	2-Br	5-Cl	H
I. 1. 719	苯基	2-Br	6-Cl	H
I. 1. 720	苯基	2-Br	3-F	H

[0166]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 721	苯基	2-Br	4-F	H
I. 1. 722	苯基	2-Br	5-F	H
I. 1. 723	苯基	2-Br	6-F	H
I. 1. 724	苯基	2-Br	3-CH ₃	H
I. 1. 725	苯基	2-Br	4-CH ₃	H
I. 1. 726	苯基	2-Br	5-CH ₃	H
I. 1. 727	苯基	2-Br	6-CH ₃	H
I. 1. 728	苯基	2-Br	5- 乙烯基	H
I. 1. 729	苯基	2-Br	6- 乙烯基	H
I. 1. 730	苯基	2-Br	5-CF ₃	3-Cl
I. 1. 731	苯基	2-Br	5-CF ₃	4-Cl
I. 1. 732	苯基	2-Br	4-CF ₃	5-Cl
I. 1. 733	苯基	2-Br	5-CF ₃	6-Cl

I. 1. 734	苯基	2-Br	5-CF ₃	3-F
I. 1. 735	苯基	2-Br	5-CF ₃	4-F
I. 1. 736	苯基	2-Br	4-CF ₃	5-F
I. 1. 737	苯基	2-Br	5-CF ₃	6-F
I. 1. 738	苯基	2-Br	5-CF ₃	3-CH ₃
I. 1. 739	苯基	2-Br	5-CF ₃	4-CH ₃
I. 1. 740	苯基	2-Br	4-CF ₃	5-CH ₃
I. 1. 741	苯基	2-Br	5-CF ₃	6-CH ₃
I. 1. 742	苯基	2-Br	4-CF ₃	5- 乙烯基
I. 1. 743	苯基	2-Br	4-CF ₃	6- 乙烯基
I. 1. 744	苯基	2-Br	3-Cl	4-F
I. 1. 745	苯基	2-Br	3-Cl	5-F
I. 1. 746	苯基	2-Br	3-Cl	6-F
I. 1. 747	苯基	2-Br	3-Cl	4-Cl
I. 1. 748	苯基	2-Br	3-Cl	5-Cl
I. 1. 749	苯基	2-Br	3-Cl	6-Cl
I. 1. 750	苯基	2-Br	3-Cl	4-CH ₃
I. 1. 751	苯基	2-Br	3-Cl	5-CH ₃
I. 1. 752	苯基	2-Br	3-Cl	6-CH ₃
I. 1. 753	苯基	2-Br	3-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 754	苯基	2-Br	3-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 755	苯基	2-Br	3-F	4-F
I. 1. 756	苯基	2-Br	3-F	5-F

[0167]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 757	苯基	2-Br	3-F	6-F
I. 1. 758	苯基	2-Br	3-F	4-Cl
I. 1. 759	苯基	2-Br	3-F	5-Cl
I. 1. 760	苯基	2-Br	3-F	6-Cl
I. 1. 761	苯基	2-Br	3-F	4-CH ₃
I. 1. 762	苯基	2-Br	3-F	5-CH ₃
I. 1. 763	苯基	2-Br	3-F	6-CH ₃
I. 1. 764	苯基	2-Br	3-F	5- 乙烯基
I. 1. 765	苯基	2-Br	3-F	6- 乙烯基
I. 1. 766	苯基	2-Br	3-CH ₃	4-F
I. 1. 767	苯基	2-Br	3-CH ₃	5-F
I. 1. 768	苯基	2-Br	3-CH ₃	6-F
I. 1. 769	苯基	2-Br	3-CH ₃	4-Cl
I. 1. 770	苯基	2-Br	3-CH ₃	5-Cl
I. 1. 771	苯基	2-Br	3-CH ₃	6-Cl
I. 1. 772	苯基	2-Br	3-CH ₃	4-CH ₃
I. 1. 773	苯基	2-Br	3-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 774	苯基	2-Br	3-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 775	苯基	2-Br	3-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 776	苯基	2-Br	3-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 777	苯基	2-Br	4-Cl	5-F
I. 1. 778	苯基	2-Br	4-Cl	6-F
I. 1. 779	苯基	2-Br	4-Cl	5-Cl

I. 1. 780	苯基	2-Br	4-Cl	6-Cl
I. 1. 781	苯基	2-Br	4-Cl	5-CH ₃
I. 1. 782	苯基	2-Br	4-Cl	6-CH ₃
I. 1. 783	苯基	2-Br	4-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 784	苯基	2-Br	4-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 785	苯基	2-Br	4-F	5-F
I. 1. 786	苯基	2-Br	4-F	6-F
I. 1. 787	苯基	2-Br	4-F	5-Cl
I. 1. 788	苯基	2-Br	4-F	6-Cl
I. 1. 789	苯基	2-Br	4-F	5-CH ₃
I. 1. 790	苯基	2-Br	4-F	6-CH ₃
I. 1. 791	苯基	2-Br	4-F	5- 乙烯基
I. 1. 792	苯基	2-Br	4-F	6- 乙烯基

[0168]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 793	苯基	2-Br	4-CH ₃	5-F
I. 1. 794	苯基	2-Br	4-CH ₃	6-F
I. 1. 795	苯基	2-Br	4-CH ₃	5-Cl
I. 1. 796	苯基	2-Br	4-CH ₃	6-Cl
I. 1. 797	苯基	2-Br	4-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 798	苯基	2-Br	4-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 799	苯基	2-Br	4-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 800	苯基	2-Br	4-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 801	苯基	2-Br	5-Cl	6-Cl

I. 1. 802	苯基	2-Br	5-Cl	6-F
I. 1. 803	苯基	2-Br	5-Cl	6-CH ₃
I. 1. 804	苯基	2-Br	5-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 805	苯基	2-Br	5-F	6-Cl
I. 1. 806	苯基	2-Br	5-F	6-F
I. 1. 807	苯基	2-Br	5-F	6-CH ₃
I. 1. 808	苯基	2-Br	5-F	6- 乙烯基
I. 1. 809	苯基	2-Br	5-CH ₃	6-Cl
I. 1. 810	苯基	2-Br	5-CH ₃	6-F
I. 1. 811	苯基	2-Br	5-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 812	苯基	2-Br	5-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 813	苯基	2-Br	5- 乙烯基	6-Cl
I. 1. 814	苯基	2-Br	5- 乙烯基	6-F
I. 1. 815	苯基	2-Br	5- 乙烯基	6-CH ₃
I. 1. 816	苯基	2-Br	5- 乙烯基	6- 乙烯基
I. 1. 817	苯基	2-Cl	H	H
I. 1. 818	苯基	2-Cl	3-Cl	H
I. 1. 819	苯基	2-Cl	4-Cl	H
I. 1. 820	苯基	2-Cl	5-Cl	H
I. 1. 821	苯基	2-Cl	6-Cl	H
I. 1. 822	苯基	2-Cl	3-F	H
I. 1. 823	苯基	2-Cl	4-F	H
I. 1. 824	苯基	2-Cl	5-F	H
I. 1. 825	苯基	2-Cl	6-F	H

I. 1. 826	苯基	2-Cl	3-CH ₃	H
I. 1. 827	苯基	2-Cl	4-CH ₃	H
I. 1. 828	苯基	2-Cl	5-CH ₃	H

[0169]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 829	苯基	2-Cl	6-CH ₃	H
I. 1. 830	苯基	2-Cl	5- 乙烯基	H
I. 1. 831	苯基	2-Cl	6- 乙烯基	H
I. 1. 832	苯基	2-Cl	5-CF ₃	3-Cl
I. 1. 833	苯基	2-Cl	5-CF ₃	4-Cl
I. 1. 834	苯基	2-Cl	4-CF ₃	5-Cl
I. 1. 835	苯基	2-Cl	5-CF ₃	6-Cl
I. 1. 836	苯基	2-Cl	5-CF ₃	3-F
I. 1. 837	苯基	2-Cl	5-CF ₃	4-F
I. 1. 838	苯基	2-Cl	4-CF ₃	5-F
I. 1. 839	苯基	2-Cl	5-CF ₃	6-F
I. 1. 840	苯基	2-Cl	5-CF ₃	3-CH ₃
I. 1. 841	苯基	2-Cl	5-CF ₃	4-CH ₃
I. 1. 842	苯基	2-Cl	4-CF ₃	5-CH ₃
I. 1. 843	苯基	2-Cl	5-CF ₃	6-CH ₃
I. 1. 844	苯基	2-Cl	4-CF ₃	5- 乙烯基
I. 1. 845	苯基	2-Cl	4-CF ₃	6- 乙烯基
I. 1. 846	苯基	2-Cl	3-Cl	4-F
I. 1. 847	苯基	2-Cl	3-Cl	5-F

I. 1. 848	苯基	2-Cl	3-Cl	6-F
I. 1. 849	苯基	2-Cl	3-Cl	4-Cl
I. 1. 850	苯基	2-Cl	3-Cl	5-Cl
I. 1. 851	苯基	2-Cl	3-Cl	6-Cl
I. 1. 852	苯基	2-Cl	3-Cl	4-CH ₃
I. 1. 853	苯基	2-Cl	3-Cl	5-CH ₃
I. 1. 854	苯基	2-Cl	3-Cl	6-CH ₃
I. 1. 855	苯基	2-Cl	3-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 856	苯基	2-Cl	3-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 857	苯基	2-Cl	3-F	4-F
I. 1. 858	苯基	2-Cl	3-F	5-F
I. 1. 859	苯基	2-Cl	3-F	6-F
I. 1. 860	苯基	2-Cl	3-F	4-Cl
I. 1. 861	苯基	2-Cl	3-F	5-Cl
I. 1. 862	苯基	2-Cl	3-F	6-Cl
I. 1. 863	苯基	2-Cl	3-F	4-CH ₃
I. 1. 864	苯基	2-Cl	3-F	5-CH ₃

[0170]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 865	苯基	2-Cl	3-F	6-CH ₃
I. 1. 866	苯基	2-Cl	3-F	5- 乙烯基
I. 1. 867	苯基	2-Cl	3-F	6- 乙烯基
I. 1. 868	苯基	2-Cl	3-CH ₃	4-F
I. 1. 869	苯基	2-Cl	3-CH ₃	5-F

I. 1. 870	苯基	2-Cl	3-CH ₃	6-F
I. 1. 871	苯基	2-Cl	3-CH ₃	4-Cl
I. 1. 872	苯基	2-Cl	3-CH ₃	5-Cl
I. 1. 873	苯基	2-Cl	3-CH ₃	6-Cl
I. 1. 874	苯基	2-Cl	3-CH ₃	4-CH ₃
I. 1. 875	苯基	2-Cl	3-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 876	苯基	2-Cl	3-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 877	苯基	2-Cl	3-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 878	苯基	2-Cl	3-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 879	苯基	2-Cl	4-Cl	5-F
I. 1. 880	苯基	2-Cl	4-Cl	6-F
I. 1. 881	苯基	2-Cl	4-Cl	5-Cl
I. 1. 882	苯基	2-Cl	4-Cl	6-Cl
I. 1. 883	苯基	2-Cl	4-Cl	5-CH ₃
I. 1. 884	苯基	2-Cl	4-Cl	6-CH ₃
I. 1. 885	苯基	2-Cl	4-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 886	苯基	2-Cl	4-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 887	苯基	2-Cl	4-F	5-F
I. 1. 888	苯基	2-Cl	4-F	6-F
I. 1. 889	苯基	2-Cl	4-F	5-Cl
I. 1. 890	苯基	2-Cl	4-F	6-Cl
I. 1. 891	苯基	2-Cl	4-F	5-CH ₃
I. 1. 892	苯基	2-Cl	4-F	6-CH ₃
I. 1. 893	苯基	2-Cl	4-F	5- 乙烯基

I. 1. 894	苯基	2-Cl	4-F	6- 乙烯基
I. 1. 895	苯基	2-Cl	4-CH ₃	5-F
I. 1. 896	苯基	2-Cl	4-CH ₃	6-F
I. 1. 897	苯基	2-Cl	4-CH ₃	5-Cl
I. 1. 898	苯基	2-Cl	4-CH ₃	6-Cl
I. 1. 899	苯基	2-Cl	4-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 900	苯基	2-Cl	4-CH ₃	6-CH ₃

[0171]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 901	苯基	2-Cl	4-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 902	苯基	2-Cl	4-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 903	苯基	2-Cl	5-Cl	6-Cl
I. 1. 904	苯基	2-Cl	5-Cl	6-F
I. 1. 905	苯基	2-Cl	5-Cl	6-CH ₃
I. 1. 906	苯基	2-Cl	5-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 907	苯基	2-Cl	5-F	6-Cl
I. 1. 908	苯基	2-Cl	5-F	6-F
I. 1. 909	苯基	2-Cl	5-F	6-CH ₃
I. 1. 910	苯基	2-Cl	5-F	6- 乙烯基
I. 1. 911	苯基	2-Cl	5-CH ₃	6-Cl
I. 1. 912	苯基	2-Cl	5-CH ₃	6-F
I. 1. 913	苯基	2-Cl	5-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 914	苯基	2-Cl	5-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 915	苯基	2-Cl	5- 乙烯基	6-Cl

I. 1. 916	苯基	2-Cl	5- 乙烯基	6-F
I. 1. 917	苯基	2-Cl	5- 乙烯基	6-CH ₃
I. 1. 918	苯基	2-Cl	5- 乙烯基	6- 乙烯基
I. 1. 919	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	H	H
I. 1. 920	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	H
I. 1. 921	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	H
I. 1. 922	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	H
I. 1. 923	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	6-Cl	H
I. 1. 924	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	H
I. 1. 925	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	H
I. 1. 926	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-F	H
I. 1. 927	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	6-F	H
I. 1. 928	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	H
I. 1. 929	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 930	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 931	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	6-CH ₃	H
I. 1. 932	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5- 乙烯基	H
I. 1. 933	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	6- 乙烯基	H
I. 1. 934	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	3-Cl
I. 1. 935	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	4-Cl
I. 1. 936	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CF ₃	5-Cl

[0172]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 937	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	6-Cl

I. 1. 938	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	3-F
I. 1. 939	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	4-F
I. 1. 940	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CF ₃	5-F
I. 1. 941	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	6-F
I. 1. 942	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	3-CH ₃
I. 1. 943	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	4-CH ₃
I. 1. 944	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CF ₃	5-CH ₃
I. 1. 945	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	6-CH ₃
I. 1. 946	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CF ₃	5- 乙烯基
I. 1. 947	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CF ₃	6- 乙烯基
I. 1. 948	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	4-F
I. 1. 949	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	5-F
I. 1. 950	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	6-F
I. 1. 951	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	4-Cl
I. 1. 952	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	5-Cl
I. 1. 953	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	6-Cl
I. 1. 954	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	4-CH ₃
I. 1. 955	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	5-CH ₃
I. 1. 956	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	6-CH ₃
I. 1. 957	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 958	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 959	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	4-F
I. 1. 960	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	5-F
I. 1. 961	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	6-F

I. 1. 962	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	4-Cl
I. 1. 963	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	5-Cl
I. 1. 964	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	6-Cl
I. 1. 965	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	4-CH ₃
I. 1. 966	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	5-CH ₃
I. 1. 967	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	6-CH ₃
I. 1. 968	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	5- 乙烯基
I. 1. 969	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	6- 乙烯基
I. 1. 970	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	4-F
I. 1. 971	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	5-F
I. 1. 972	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	6-F

[0173]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 973	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	4-Cl
I. 1. 974	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	5-Cl
I. 1. 975	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	6-Cl
I. 1. 976	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	4-CH ₃
I. 1. 977	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 978	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 979	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 980	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 981	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 982	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	6-F
I. 1. 983	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	5-Cl

I. 1. 984	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	6-Cl
I. 1. 985	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	5-CH ₃
I. 1. 986	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	6-CH ₃
I. 1. 987	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 988	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 989	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	5-F
I. 1. 990	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	6-F
I. 1. 991	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	5-Cl
I. 1. 992	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	6-Cl
I. 1. 993	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	5-CH ₃
I. 1. 994	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	6-CH ₃
I. 1. 995	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	5- 乙烯基
I. 1. 996	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	6- 乙烯基
I. 1. 997	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	5-F
I. 1. 998	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	6-F
I. 1. 999	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	5-Cl
I. 1. 1000	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	6-Cl
I. 1. 1001	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 1002	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 1003	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 1004	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 1005	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	6-Cl
I. 1. 1006	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	6-F
I. 1. 1007	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	6-CH ₃

I. 1. 1008	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	6- 乙烯基
------------	----	--------------------------------------	------	--------

[0174]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1009	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-F	6-Cl
I. 1. 1010	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-F	6-F
I. 1. 1011	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-F	6-CH ₃
I. 1. 1012	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-F	6- 乙烯基
I. 1. 1013	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	6-Cl
I. 1. 1014	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	6-F
I. 1. 1015	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 1016	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 1017	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5- 乙烯基	6-Cl
I. 1. 1018	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5- 乙烯基	6-F
I. 1. 1019	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5- 乙烯基	6-CH ₃
I. 1. 1020	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5- 乙烯基	6- 乙烯基
I. 1. 1021	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	H	H
I. 1. 1022	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	H
I. 1. 1023	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	H
I. 1. 1024	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	H
I. 1. 1025	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	6-Cl	H
I. 1. 1026	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	H
I. 1. 1027	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	H
I. 1. 1028	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-F	H
I. 1. 1029	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	6-F	H

I. 1. 1030	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	H
I. 1. 1031	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 1032	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 1033	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	6-CH ₃	H
I. 1. 1034	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5- 乙烯基	H
I. 1. 1035	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	6- 乙烯基	H
I. 1. 1036	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	3-Cl
I. 1. 1037	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	4-Cl
I. 1. 1038	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CF ₃	5-Cl
I. 1. 1039	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	6-Cl
I. 1. 1040	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	3-F
I. 1. 1041	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	4-F
I. 1. 1042	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CF ₃	5-F
I. 1. 1043	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	6-F
I. 1. 1044	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	3-CH ₃

[0175]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1045	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	4-CH ₃
I. 1. 1046	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CF ₃	5-CH ₃
I. 1. 1047	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	6-CH ₃
I. 1. 1048	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	5- 乙烯基
I. 1. 1049	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CF ₃	6- 乙烯基
I. 1. 1050	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	4-F
I. 1. 1051	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	5-F

I. 1. 1052	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	6-F
I. 1. 1053	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	4-Cl
I. 1. 1054	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	5-Cl
I. 1. 1055	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	6-Cl
I. 1. 1056	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	4-CH ₃
I. 1. 1057	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	5-CH ₃
I. 1. 1058	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	6-CH ₃
I. 1. 1059	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 1060	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 1061	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	4-F
I. 1. 1062	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	5-F
I. 1. 1063	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	6-F
I. 1. 1064	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	4-Cl
I. 1. 1065	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	5-Cl
I. 1. 1066	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	6-Cl
I. 1. 1067	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	4-CH ₃
I. 1. 1068	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	5-CH ₃
I. 1. 1069	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	6-CH ₃
I. 1. 1070	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	5- 乙烯基
I. 1. 1071	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-F	6- 乙烯基
I. 1. 1072	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	4-F
I. 1. 1073	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	5-F
I. 1. 1074	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	6-F
I. 1. 1075	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	4-Cl

I. 1. 1076	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	5-Cl
I. 1. 1077	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	6-Cl
I. 1. 1078	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	4-CH ₃
I. 1. 1079	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 1080	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	6-CH ₃

[0176]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1081	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 1082	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	3-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 1083	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 1084	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	6-F
I. 1. 1085	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	5-Cl
I. 1. 1086	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	6-Cl
I. 1. 1087	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	5-CH ₃
I. 1. 1088	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	6-CH ₃
I. 1. 1089	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	5- 乙烯基
I. 1. 1090	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 1091	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	5-F
I. 1. 1092	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	6-F
I. 1. 1093	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	5-Cl
I. 1. 1094	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	6-Cl
I. 1. 1095	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	5-CH ₃
I. 1. 1096	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	6-CH ₃
I. 1. 1097	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	5- 乙烯基

I. 1. 1098	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	6- 乙烯基
I. 1. 1099	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	5-F
I. 1. 1100	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	6-F
I. 1. 1101	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	5-Cl
I. 1. 1102	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	6-Cl
I. 1. 1103	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	5-CH ₃
I. 1. 1104	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 1105	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	5- 乙烯基
I. 1. 1106	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 1107	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	6-Cl
I. 1. 1108	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	6-F
I. 1. 1109	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	6-CH ₃
I. 1. 1110	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	6- 乙烯基
I. 1. 1111	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-F	6-Cl
I. 1. 1112	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-F	6-F
I. 1. 1113	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-F	6-CH ₃
I. 1. 1114	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-F	6- 乙烯基
I. 1. 1115	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	6-Cl
I. 1. 1116	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	6-F

[0177]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1117	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	6-CH ₃
I. 1. 1118	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	6- 乙烯基
I. 1. 1119	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5- 乙烯基	6-Cl

I. 1. 1120	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5- 乙烯基	6-F
I. 1. 1121	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5- 乙烯基	6-CH ₃
I. 1. 1122	苯基	2-COOCH ₂ CH ₃	5- 乙烯基	6- 乙烯基
I. 1. 1123	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	4-Cl	5-F
I. 1. 1124	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	4-Cl	H
I. 1. 1125	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	5-Cl	H
I. 1. 1126	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	6-Cl	H
I. 1. 1127	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	4-F	H
I. 1. 1128	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	5-F	H
I. 1. 1129	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	6-F	H
I. 1. 1130	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	4-Br	H
I. 1. 1131	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	5-Br	H
I. 1. 1132	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	6-Br	H
I. 1. 1133	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	4-CH ₃	H
I. 1. 1134	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 1135	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	6-CH ₃	H
I. 1. 1136	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	4-CF ₃	H
I. 1. 1137	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 1138	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	6-CF ₃	H
I. 1. 1139	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	4- 乙烯基	H
I. 1. 1140	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	5- 乙烯基	H
I. 1. 1141	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	6- 乙烯基	H
I. 1. 1142	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	4-Cl	6-F
I. 1. 1143	吡啶 -2- 基	3-NO ₂	5-Cl	6-F

I. 1. 1144	吡啶-2-基	3-CN	4-Cl	5-F
I. 1. 1145	吡啶-2-基	3-CN	4-Cl	H
I. 1. 1146	吡啶-2-基	3-CN	5-Cl	H
I. 1. 1147	吡啶-2-基	3-CN	6-Cl	H
I. 1. 1148	吡啶-2-基	3-CN	4-F	H
I. 1. 1149	吡啶-2-基	3-CN	5-F	H
I. 1. 1150	吡啶-2-基	3-CN	6-F	H
I. 1. 1151	吡啶-2-基	3-CN	4-Br	H
I. 1. 1152	吡啶-2-基	3-CN	5-Br	H

[0178]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1153	吡啶-2-基	3-CN	6-Br	H
I. 1. 1154	吡啶-2-基	3-CN	4-CH ₃	H
I. 1. 1155	吡啶-2-基	3-CN	5-CH ₃	H
I. 1. 1156	吡啶-2-基	3-CN	6-CH ₃	H
I. 1. 1157	吡啶-2-基	3-CN	4-CF ₃	H
I. 1. 1158	吡啶-2-基	3-CN	5-CF ₃	H
I. 1. 1159	吡啶-2-基	3-CN	6-CF ₃	H
I. 1. 1160	吡啶-2-基	3-CN	4-乙烯基	H
I. 1. 1161	吡啶-2-基	3-CN	5-乙烯基	H
I. 1. 1162	吡啶-2-基	3-CN	6-乙烯基	H
I. 1. 1163	吡啶-2-基	3-CN	4-Cl	6-F
I. 1. 1164	吡啶-2-基	3-CN	5-Cl	6-F
I. 1. 1165	吡啶-2-基	3-Br	4-Cl	5-F

I. 1. 1166	吡啶-2-基	3-Br	4-Cl	H
I. 1. 1167	吡啶-2-基	3-Br	5-Cl	H
I. 1. 1168	吡啶-2-基	3-Br	6-Cl	H
I. 1. 1169	吡啶-2-基	3-Br	4-F	H
I. 1. 1170	吡啶-2-基	3-Br	5-F	H
I. 1. 1171	吡啶-2-基	3-Br	6-F	H
I. 1. 1172	吡啶-2-基	3-Br	4-Br	H
I. 1. 1173	吡啶-2-基	3-Br	5-Br	H
I. 1. 1174	吡啶-2-基	3-Br	6-Br	H
I. 1. 1175	吡啶-2-基	3-Br	4-CH ₃	H
I. 1. 1176	吡啶-2-基	3-Br	5-CH ₃	H
I. 1. 1177	吡啶-2-基	3-Br	6-CH ₃	H
I. 1. 1178	吡啶-2-基	3-Br	4-CF ₃	H
I. 1. 1179	吡啶-2-基	3-Br	5-CF ₃	H
I. 1. 1180	吡啶-2-基	3-Br	6-CF ₃	H
I. 1. 1181	吡啶-2-基	3-Br	4-乙烯基	H
I. 1. 1182	吡啶-2-基	3-Br	5-乙烯基	H
I. 1. 1183	吡啶-2-基	3-Br	6-乙烯基	H
I. 1. 1184	吡啶-2-基	3-Br	4-Cl	6-F
I. 1. 1185	吡啶-2-基	3-Br	5-Cl	6-F
I. 1. 1186	吡啶-2-基	3-Cl	4-Cl	5-F
I. 1. 1187	吡啶-2-基	3-Cl	4-Cl	H
I. 1. 1188	吡啶-2-基	3-Cl	5-Cl	H

[0179]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1189	吡啶 -2- 基	3-Cl	6-Cl	H
I. 1. 1190	吡啶 -2- 基	3-Cl	4-F	H
I. 1. 1191	吡啶 -2- 基	3-Cl	5-F	H
I. 1. 1192	吡啶 -2- 基	3-Cl	6-F	H
I. 1. 1193	吡啶 -2- 基	3-Cl	4-Br	H
I. 1. 1194	吡啶 -2- 基	3-Cl	5-Br	H
I. 1. 1195	吡啶 -2- 基	3-Cl	6-Br	H
I. 1. 1196	吡啶 -2- 基	3-Cl	4-CH ₃	H
I. 1. 1197	吡啶 -2- 基	3-Cl	5-CH ₃	H
I. 1. 1198	吡啶 -2- 基	3-Cl	6-CH ₃	H
I. 1. 1199	吡啶 -2- 基	3-Cl	4-CF ₃	H
I. 1. 1200	吡啶 -2- 基	3-Cl	5-CF ₃	H
I. 1. 1201	吡啶 -2- 基	3-Cl	6-CF ₃	H
I. 1. 1202	吡啶 -2- 基	3-Cl	4- 乙烯基	H
I. 1. 1203	吡啶 -2- 基	3-Cl	5- 乙烯基	H
I. 1. 1204	吡啶 -2- 基	3-Cl	6- 乙烯基	H
I. 1. 1205	吡啶 -2- 基	3-Cl	4-Cl	6-F
I. 1. 1206	吡啶 -2- 基	3-Cl	5-Cl	6-F
I. 1. 1207	吡啶 -2- 基	3- 乙炔基	4-Cl	5-F
I. 1. 1208	吡啶 -2- 基	3- 乙炔基	4-Cl	H
I. 1. 1209	吡啶 -2- 基	3- 乙炔基	5-Cl	H
I. 1. 1210	吡啶 -2- 基	3- 乙炔基	6-Cl	H
I. 1. 1211	吡啶 -2- 基	3- 乙炔基	4-F	H

I. 1. 1212	吡啶-2-基	3-乙炔基	5-F	H
I. 1. 1213	吡啶-2-基	3-乙炔基	6-F	H
I. 1. 1214	吡啶-2-基	3-乙炔基	4-Br	H
I. 1. 1215	吡啶-2-基	3-乙炔基	5-Br	H
I. 1. 1216	吡啶-2-基	3-乙炔基	6-Br	H
I. 1. 1217	吡啶-2-基	3-乙炔基	4-CH ₃	H
I. 1. 1218	吡啶-2-基	3-乙炔基	5-CH ₃	H
I. 1. 1219	吡啶-2-基	3-乙炔基	6-CH ₃	H
I. 1. 1220	吡啶-2-基	3-乙炔基	4-CF ₃	H
I. 1. 1221	吡啶-2-基	3-乙炔基	5-CF ₃	H
I. 1. 1222	吡啶-2-基	3-乙炔基	6-CF ₃	H
I. 1. 1223	吡啶-2-基	3-乙炔基	4-乙烯基	H
I. 1. 1224	吡啶-2-基	3-乙炔基	5-乙烯基	H

[0180]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1225	吡啶-2-基	3-乙炔基	6-乙烯基	H
I. 1. 1226	吡啶-2-基	3-乙炔基	4-Cl	6-F
I. 1. 1227	吡啶-2-基	3-乙炔基	5-Cl	6-F
I. 1. 1228	吡啶-2-基	3-I	4-Cl	5-F
I. 1. 1229	吡啶-2-基	3-I	4-Cl	H
I. 1. 1230	吡啶-2-基	3-I	5-Cl	H
I. 1. 1231	吡啶-2-基	3-I	6-Cl	H
I. 1. 1232	吡啶-2-基	3-I	4-F	H
I. 1. 1233	吡啶-2-基	3-I	5-F	H

I. 1. 1234	吡啶-2-基	3-I	6-F	H
I. 1. 1235	吡啶-2-基	3-I	4-Br	H
I. 1. 1236	吡啶-2-基	3-I	5-Br	H
I. 1. 1237	吡啶-2-基	3-I	6-Br	H
I. 1. 1238	吡啶-2-基	3-I	4-CH ₃	H
I. 1. 1239	吡啶-2-基	3-I	5-CH ₃	H
I. 1. 1240	吡啶-2-基	3-I	6-CH ₃	H
I. 1. 1241	吡啶-2-基	3-I	4-CF ₃	H
I. 1. 1242	吡啶-2-基	3-I	5-CF ₃	H
I. 1. 1243	吡啶-2-基	3-I	6-CF ₃	H
I. 1. 1244	吡啶-2-基	3-I	4-乙烯基	H
I. 1. 1245	吡啶-2-基	3-I	5-乙烯基	H
I. 1. 1246	吡啶-2-基	3-I	6-乙烯基	H
I. 1. 1247	吡啶-2-基	3-I	4-Cl	6-F
I. 1. 1248	吡啶-2-基	3-I	5-Cl	6-F
I. 1. 1249	吡啶-2-基	3-COOH	4-Cl	5-F
I. 1. 1250	吡啶-2-基	3-COOH	4-Cl	H
I. 1. 1251	吡啶-2-基	3-COOH	5-Cl	H
I. 1. 1252	吡啶-2-基	3-COOH	6-Cl	H
I. 1. 1253	吡啶-2-基	3-COOH	4-F	H
I. 1. 1254	吡啶-2-基	3-COOH	5-F	H
I. 1. 1255	吡啶-2-基	3-COOH	6-F	H
I. 1. 1256	吡啶-2-基	3-COOH	4-Br	H
I. 1. 1257	吡啶-2-基	3-COOH	5-Br	H

I. 1. 1258	吡啶 -2- 基	3-COOH	6-Br	H
I. 1. 1259	吡啶 -2- 基	3-COOH	4-CH ₃	H
I. 1. 1260	吡啶 -2- 基	3-COOH	5-CH ₃	H

[0181]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1261	吡啶 -2- 基	3-COOH	6-CH ₃	H
I. 1. 1262	吡啶 -2- 基	3-COOH	4-CF ₃	H
I. 1. 1263	吡啶 -2- 基	3-COOH	5-CF ₃	H
I. 1. 1264	吡啶 -2- 基	3-COOH	6-CF ₃	H
I. 1. 1265	吡啶 -2- 基	3-COOH	4- 乙烯基	H
I. 1. 1266	吡啶 -2- 基	3-COOH	5- 乙烯基	H
I. 1. 1267	吡啶 -2- 基	3-COOH	6- 乙烯基	H
I. 1. 1268	吡啶 -2- 基	3-COOH	4-Cl	6-F
I. 1. 1269	吡啶 -2- 基	3-COOH	5-Cl	6-F
I. 1. 1270	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 1271	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	4-Cl	H
I. 1. 1272	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 1273	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	6-Cl	H
I. 1. 1274	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	4-F	H
I. 1. 1275	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	5-F	H
I. 1. 1276	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	6-F	H
I. 1. 1277	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	4-Br	H
I. 1. 1278	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	5-Br	H
I. 1. 1279	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	6-Br	H

I. 1. 1280	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 1281	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 1282	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	6-CH ₃	H
I. 1. 1283	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 1284	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 1285	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	6-CF ₃	H
I. 1. 1286	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	4- 乙烯基	H
I. 1. 1287	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	5- 乙烯基	H
I. 1. 1288	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	6- 乙烯基	H
I. 1. 1289	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	4-Cl	6-F
I. 1. 1290	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₃	5-Cl	6-F
I. 1. 1291	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 1292	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	H
I. 1. 1293	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	H
I. 1. 1294	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	6-Cl	H
I. 1. 1295	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-F	H
I. 1. 1296	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-F	H

[0182]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1297	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	6-F	H
I. 1. 1298	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-Br	H
I. 1. 1299	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-Br	H
I. 1. 1300	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	6-Br	H
I. 1. 1301	吡啶 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	H

I. 1. 1302	吡啶-2-基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 1303	吡啶-2-基	3-COOCH ₂ CH ₃	6-CH ₃	H
I. 1. 1304	吡啶-2-基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 1305	吡啶-2-基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 1306	吡啶-2-基	3-COOCH ₂ CH ₃	6-CF ₃	H
I. 1. 1307	吡啶-2-基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-乙烯基	H
I. 1. 1308	吡啶-2-基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-乙烯基	H
I. 1. 1309	吡啶-2-基	3-COOCH ₂ CH ₃	6-乙烯基	H
I. 1. 1310	吡啶-2-基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	6-F
I. 1. 1311	吡啶-2-基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	6-F
I. 1. 1312	吡啶-2-基	3-CONHCH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 1313	吡啶-2-基	3-CONHCH ₃	4-Cl	H
I. 1. 1314	吡啶-2-基	3-CONHCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 1315	吡啶-2-基	3-CONHCH ₃	6-Cl	H
I. 1. 1316	吡啶-2-基	3-CONHCH ₃	4-F	H
I. 1. 1317	吡啶-2-基	3-CONHCH ₃	5-F	H
I. 1. 1318	吡啶-2-基	3-CONHCH ₃	6-F	H
I. 1. 1319	吡啶-2-基	3-CONHCH ₃	4-Br	H
I. 1. 1320	吡啶-2-基	3-CONHCH ₃	5-Br	H
I. 1. 1321	吡啶-2-基	3-CONHCH ₃	6-Br	H
I. 1. 1322	吡啶-2-基	3-CONHCH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 1323	吡啶-2-基	3-CONHCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 1324	吡啶-2-基	3-CONHCH ₃	6-CH ₃	H
I. 1. 1325	吡啶-2-基	3-CONHCH ₃	4-CF ₃	H

I. 1. 1326	吡啶 -2- 基	3-CONHCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 1327	吡啶 -2- 基	3-CONHCH ₃	6-CF ₃	H
I. 1. 1328	吡啶 -2- 基	3-CONHCH ₃	4- 乙烯基	H
I. 1. 1329	吡啶 -2- 基	3-CONHCH ₃	5- 乙烯基	H
I. 1. 1330	吡啶 -2- 基	3-CONHCH ₃	6- 乙烯基	H
I. 1. 1331	吡啶 -2- 基	3-CONHCH ₃	4-Cl	6-F
I. 1. 1332	吡啶 -2- 基	3-CONHCH ₃	5-Cl	6-F

[0183]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1333	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-Cl	5-F
I. 1. 1334	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-Cl	H
I. 1. 1335	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	H
I. 1. 1336	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	6-Cl	H
I. 1. 1337	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-F	H
I. 1. 1338	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-F	H
I. 1. 1339	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	6-F	H
I. 1. 1340	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-Br	H
I. 1. 1341	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-Br	H
I. 1. 1342	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	6-Br	H
I. 1. 1343	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-CH ₃	H
I. 1. 1344	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 1345	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	6-CH ₃	H
I. 1. 1346	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-CF ₃	H
I. 1. 1347	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	H

I. 1. 1348	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	6-CF ₃	H
I. 1. 1349	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4- 乙烯基	H
I. 1. 1350	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5- 乙烯基	H
I. 1. 1351	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	6- 乙烯基	H
I. 1. 1352	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-Cl	6-F
I. 1. 1353	吡啶 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	6-F
I. 1. 1354	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	4-Cl	5-F
I. 1. 1355	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	4-Cl	H
I. 1. 1356	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	5-Cl	H
I. 1. 1357	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	6-Cl	H
I. 1. 1358	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	4-F	H
I. 1. 1359	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	5-F	H
I. 1. 1360	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	6-F	H
I. 1. 1361	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	4-Br	H
I. 1. 1362	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	5-Br	H
I. 1. 1363	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	6-Br	H
I. 1. 1364	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	4-CH ₃	H
I. 1. 1365	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 1366	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	6-CH ₃	H
I. 1. 1367	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	4-CF ₃	H
I. 1. 1368	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	5-CF ₃	H

[0184]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1369	吡啶 -3- 基	2-NO ₂	6-CF ₃	H

I. 1. 1370	吡啶-3-基	2-NO ₂	4-乙烯基	H
I. 1. 1371	吡啶-3-基	2-NO ₂	5-乙烯基	H
I. 1. 1372	吡啶-3-基	2-NO ₂	6-乙烯基	H
I. 1. 1373	吡啶-3-基	2-NO ₂	4-Cl	6-F
I. 1. 1374	吡啶-3-基	2-NO ₂	5-Cl	6-F
I. 1. 1375	吡啶-3-基	2-CN	4-Cl	5-F
I. 1. 1376	吡啶-3-基	2-CN	4-Cl	H
I. 1. 1377	吡啶-3-基	2-CN	5-Cl	H
I. 1. 1378	吡啶-3-基	2-CN	6-Cl	H
I. 1. 1379	吡啶-3-基	2-CN	4-F	H
I. 1. 1380	吡啶-3-基	2-CN	5-F	H
I. 1. 1381	吡啶-3-基	2-CN	6-F	H
I. 1. 1382	吡啶-3-基	2-CN	4-Br	H
I. 1. 1383	吡啶-3-基	2-CN	5-Br	H
I. 1. 1384	吡啶-3-基	2-CN	6-Br	H
I. 1. 1385	吡啶-3-基	2-CN	4-CH ₃	H
I. 1. 1386	吡啶-3-基	2-CN	5-CH ₃	H
I. 1. 1387	吡啶-3-基	2-CN	6-CH ₃	H
I. 1. 1388	吡啶-3-基	2-CN	4-CF ₃	H
I. 1. 1389	吡啶-3-基	2-CN	5-CF ₃	H
I. 1. 1390	吡啶-3-基	2-CN	6-CF ₃	H
I. 1. 1391	吡啶-3-基	2-CN	4-乙烯基	H
I. 1. 1392	吡啶-3-基	2-CN	5-乙烯基	H
I. 1. 1393	吡啶-3-基	2-CN	6-乙烯基	H

I. 1. 1394	吡啶-3-基	2-CN	4-Cl	6-F
I. 1. 1395	吡啶-3-基	2-CN	5-Cl	6-F
I. 1. 1396	吡啶-3-基	2-Br	4-Cl	5-F
I. 1. 1397	吡啶-3-基	2-Br	4-Cl	H
I. 1. 1398	吡啶-3-基	2-Br	5-Cl	H
I. 1. 1399	吡啶-3-基	2-Br	6-Cl	H
I. 1. 1400	吡啶-3-基	2-Br	4-F	H
I. 1. 1401	吡啶-3-基	2-Br	5-F	H
I. 1. 1402	吡啶-3-基	2-Br	6-F	H
I. 1. 1403	吡啶-3-基	2-Br	4-Br	H
I. 1. 1404	吡啶-3-基	2-Br	5-Br	H

[0185]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1405	吡啶-3-基	2-Br	6-Br	H
I. 1. 1406	吡啶-3-基	2-Br	4-CH ₃	H
I. 1. 1407	吡啶-3-基	2-Br	5-CH ₃	H
I. 1. 1408	吡啶-3-基	2-Br	6-CH ₃	H
I. 1. 1409	吡啶-3-基	2-Br	4-CF ₃	H
I. 1. 1410	吡啶-3-基	2-Br	5-CF ₃	H
I. 1. 1411	吡啶-3-基	2-Br	6-CF ₃	H
I. 1. 1412	吡啶-3-基	2-Br	4-乙烯基	H
I. 1. 1413	吡啶-3-基	2-Br	5-乙烯基	H
I. 1. 1414	吡啶-3-基	2-Br	6-乙烯基	H
I. 1. 1415	吡啶-3-基	2-Br	4-Cl	6-F

I. 1. 1416	吡啶-3-基	2-Br	5-Cl	6-F
I. 1. 1417	吡啶-3-基	2-Cl	4-Cl	5-F
I. 1. 1418	吡啶-3-基	2-Cl	4-Cl	H
I. 1. 1419	吡啶-3-基	2-Cl	5-Cl	H
I. 1. 1420	吡啶-3-基	2-Cl	6-Cl	H
I. 1. 1421	吡啶-3-基	2-Cl	4-F	H
I. 1. 1422	吡啶-3-基	2-Cl	5-F	H
I. 1. 1423	吡啶-3-基	2-Cl	6-F	H
I. 1. 1424	吡啶-3-基	2-Cl	4-Br	H
I. 1. 1425	吡啶-3-基	2-Cl	5-Br	H
I. 1. 1426	吡啶-3-基	2-Cl	6-Br	H
I. 1. 1427	吡啶-3-基	2-Cl	4-CH ₃	H
I. 1. 1428	吡啶-3-基	2-Cl	5-CH ₃	H
I. 1. 1429	吡啶-3-基	2-Cl	6-CH ₃	H
I. 1. 1430	吡啶-3-基	2-Cl	4-CF ₃	H
I. 1. 1431	吡啶-3-基	2-Cl	5-CF ₃	H
I. 1. 1432	吡啶-3-基	2-Cl	6-CF ₃	H
I. 1. 1433	吡啶-3-基	2-Cl	4-乙烯基	H
I. 1. 1434	吡啶-3-基	2-Cl	5-乙烯基	H
I. 1. 1435	吡啶-3-基	2-Cl	6-乙烯基	H
I. 1. 1436	吡啶-3-基	2-Cl	4-Cl	6-F
I. 1. 1437	吡啶-3-基	2-Cl	5-Cl	6-F
I. 1. 1438	吡啶-3-基	2-乙炔基	4-Cl	5-F
I. 1. 1439	吡啶-3-基	2-乙炔基	4-Cl	H

I. 1. 1440	吡啶-3-基	2-乙炔基	5-Cl	H
------------	--------	-------	------	---

[0186]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1441	吡啶-3-基	2-乙炔基	6-Cl	H
I. 1. 1442	吡啶-3-基	2-乙炔基	4-F	H
I. 1. 1443	吡啶-3-基	2-乙炔基	5-F	H
I. 1. 1444	吡啶-3-基	2-乙炔基	6-F	H
I. 1. 1445	吡啶-3-基	2-乙炔基	4-Br	H
I. 1. 1446	吡啶-3-基	2-乙炔基	5-Br	H
I. 1. 1447	吡啶-3-基	2-乙炔基	6-Br	H
I. 1. 1448	吡啶-3-基	2-乙炔基	4-CH ₃	H
I. 1. 1449	吡啶-3-基	2-乙炔基	5-CH ₃	H
I. 1. 1450	吡啶-3-基	2-乙炔基	6-CH ₃	H
I. 1. 1451	吡啶-3-基	2-乙炔基	4-CF ₃	H
I. 1. 1452	吡啶-3-基	2-乙炔基	5-CF ₃	H
I. 1. 1453	吡啶-3-基	2-乙炔基	6-CF ₃	H
I. 1. 1454	吡啶-3-基	2-乙炔基	4-乙烯基	H
I. 1. 1455	吡啶-3-基	2-乙炔基	5-乙烯基	H
I. 1. 1456	吡啶-3-基	2-乙炔基	6-乙烯基	H
I. 1. 1457	吡啶-3-基	2-乙炔基	4-Cl	6-F
I. 1. 1458	吡啶-3-基	2-乙炔基	5-Cl	6-F
I. 1. 1459	吡啶-3-基	2-I	4-Cl	5-F
I. 1. 1460	吡啶-3-基	2-I	4-Cl	H
I. 1. 1461	吡啶-3-基	2-I	5-Cl	H

I. 1. 1462	吡啶-3-基	2-I	6-Cl	H
I. 1. 1463	吡啶-3-基	2-I	4-F	H
I. 1. 1464	吡啶-3-基	2-I	5-F	H
I. 1. 1465	吡啶-3-基	2-I	6-F	H
I. 1. 1466	吡啶-3-基	2-I	4-Br	H
I. 1. 1467	吡啶-3-基	2-I	5-Br	H
I. 1. 1468	吡啶-3-基	2-I	6-Br	H
I. 1. 1469	吡啶-3-基	2-I	4-CH ₃	H
I. 1. 1470	吡啶-3-基	2-I	5-CH ₃	H
I. 1. 1471	吡啶-3-基	2-I	6-CH ₃	H
I. 1. 1472	吡啶-3-基	2-I	4-CF ₃	H
I. 1. 1473	吡啶-3-基	2-I	5-CF ₃	H
I. 1. 1474	吡啶-3-基	2-I	6-CF ₃	H
I. 1. 1475	吡啶-3-基	2-I	4-乙烯基	H
I. 1. 1476	吡啶-3-基	2-I	5-乙烯基	H

[0187]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1477	吡啶-3-基	2-I	6-乙烯基	H
I. 1. 1478	吡啶-3-基	2-I	4-Cl	6-F
I. 1. 1479	吡啶-3-基	2-I	5-Cl	6-F
I. 1. 1480	吡啶-3-基	2-COOH	4-Cl	5-F
I. 1. 1481	吡啶-3-基	2-COOH	4-Cl	H
I. 1. 1482	吡啶-3-基	2-COOH	5-Cl	H
I. 1. 1483	吡啶-3-基	2-COOH	6-Cl	H

I. 1. 1484	吡啶-3-基	2-COOH	4-F	H
I. 1. 1485	吡啶-3-基	2-COOH	5-F	H
I. 1. 1486	吡啶-3-基	2-COOH	6-F	H
I. 1. 1487	吡啶-3-基	2-COOH	4-Br	H
I. 1. 1488	吡啶-3-基	2-COOH	5-Br	H
I. 1. 1489	吡啶-3-基	2-COOH	6-Br	H
I. 1. 1490	吡啶-3-基	2-COOH	4-CH ₃	H
I. 1. 1491	吡啶-3-基	2-COOH	5-CH ₃	H
I. 1. 1492	吡啶-3-基	2-COOH	6-CH ₃	H
I. 1. 1493	吡啶-3-基	2-COOH	4-CF ₃	H
I. 1. 1494	吡啶-3-基	2-COOH	5-CF ₃	H
I. 1. 1495	吡啶-3-基	2-COOH	6-CF ₃	H
I. 1. 1496	吡啶-3-基	2-COOH	4-乙烯基	H
I. 1. 1497	吡啶-3-基	2-COOH	5-乙烯基	H
I. 1. 1498	吡啶-3-基	2-COOH	6-乙烯基	H
I. 1. 1499	吡啶-3-基	2-COOH	4-Cl	6-F
I. 1. 1500	吡啶-3-基	2-COOH	5-Cl	6-F
I. 1. 1501	吡啶-3-基	2-COOCH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 1502	吡啶-3-基	2-COOCH ₃	4-Cl	H
I. 1. 1503	吡啶-3-基	2-COOCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 1504	吡啶-3-基	2-COOCH ₃	6-Cl	H
I. 1. 1505	吡啶-3-基	2-COOCH ₃	4-F	H
I. 1. 1506	吡啶-3-基	2-COOCH ₃	5-F	H
I. 1. 1507	吡啶-3-基	2-COOCH ₃	6-F	H

I. 1. 1508	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₃	4-Br	H
I. 1. 1509	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₃	5-Br	H
I. 1. 1510	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₃	6-Br	H
I. 1. 1511	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 1512	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₃	5-CH ₃	H

[0188]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1513	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₃	6-CH ₃	H
I. 1. 1514	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 1515	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 1516	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₃	6-CF ₃	H
I. 1. 1517	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₃	4- 乙烯基	H
I. 1. 1518	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₃	5- 乙烯基	H
I. 1. 1519	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₃	6- 乙烯基	H
I. 1. 1520	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₃	4-Cl	6-F
I. 1. 1521	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₃	5-Cl	6-F
I. 1. 1522	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 1523	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	H
I. 1. 1524	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	H
I. 1. 1525	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	6-Cl	H
I. 1. 1526	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	H
I. 1. 1527	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-F	H
I. 1. 1528	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	6-F	H
I. 1. 1529	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Br	H

I. 1. 1530	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-Br	H
I. 1. 1531	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	6-Br	H
I. 1. 1532	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 1533	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 1534	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	6-CH ₃	H
I. 1. 1535	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 1536	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 1537	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	6-CF ₃	H
I. 1. 1538	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4- 乙烯基	H
I. 1. 1539	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5- 乙烯基	H
I. 1. 1540	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	6- 乙烯基	H
I. 1. 1541	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	6-F
I. 1. 1542	吡啶 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	6-F
I. 1. 1543	吡啶 -3- 基	2-CONHCH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 1544	吡啶 -3- 基	2-CONHCH ₃	4-Cl	H
I. 1. 1545	吡啶 -3- 基	2-CONHCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 1546	吡啶 -3- 基	2-CONHCH ₃	6-Cl	H
I. 1. 1547	吡啶 -3- 基	2-CONHCH ₃	4-F	H
I. 1. 1548	吡啶 -3- 基	2-CONHCH ₃	5-F	H

[0189]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
R. 1. 1549	吡啶 -3- 基	2-CONHCH ₃	6-F	H
I. 1. 1550	吡啶 -3- 基	2-CONHCH ₃	4-Br	H
I. 1. 1551	吡啶 -3- 基	2-CONHCH ₃	5-Br	H

I. 1. 1552	吡啶-3-基	2-CONHCH ₃	6-Br	H
I. 1. 1553	吡啶-3-基	2-CONHCH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 1554	吡啶-3-基	2-CONHCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 1555	吡啶-3-基	2-CONHCH ₃	6-CH ₃	H
I. 1. 1556	吡啶-3-基	2-CONHCH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 1557	吡啶-3-基	2-CONHCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 1558	吡啶-3-基	2-CONHCH ₃	6-CF ₃	H
I. 1. 1559	吡啶-3-基	2-CONHCH ₃	4-乙烯基	H
I. 1. 1560	吡啶-3-基	2-CONHCH ₃	5-乙烯基	H
I. 1. 1561	吡啶-3-基	2-CONHCH ₃	6-乙烯基	H
I. 1. 1562	吡啶-3-基	2-CONHCH ₃	4-Cl	6-F
I. 1. 1563	吡啶-3-基	2-CONHCH ₃	5-Cl	6-F
I. 1. 1564	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-Cl	5-F
I. 1. 1565	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-Cl	H
I. 1. 1566	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	H
I. 1. 1567	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	6-Cl	H
I. 1. 1568	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-F	H
I. 1. 1569	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-F	H
I. 1. 1570	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	6-F	H
I. 1. 1571	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-Br	H
I. 1. 1572	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-Br	H
I. 1. 1573	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	6-Br	H
I. 1. 1574	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-CH ₃	H
I. 1. 1575	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CH ₃	H

I. 1. 1576	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	6-CH ₃	H
I. 1. 1577	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-CF ₃	H
I. 1. 1578	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 1579	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	6-CF ₃	H
I. 1. 1580	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-乙烯基	H
I. 1. 1581	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-乙烯基	H
I. 1. 1582	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	6-乙烯基	H
I. 1. 1583	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-Cl	6-F
I. 1. 1584	吡啶-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	6-F

[0190]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1585	吡啶-3-基	4-NO ₂	2-Cl	5-F
I. 1. 1586	吡啶-3-基	4-NO ₂	2-Cl	H
I. 1. 1587	吡啶-3-基	4-NO ₂	5-Cl	H
I. 1. 1588	吡啶-3-基	4-NO ₂	6-Cl	H
I. 1. 1589	吡啶-3-基	4-NO ₂	2-F	H
I. 1. 1590	吡啶-3-基	4-NO ₂	5-F	H
I. 1. 1591	吡啶-3-基	4-NO ₂	6-F	H
I. 1. 1592	吡啶-3-基	4-NO ₂	2-Br	H
I. 1. 1593	吡啶-3-基	4-NO ₂	5-Br	H
I. 1. 1594	吡啶-3-基	4-NO ₂	6-Br	H
I. 1. 1595	吡啶-3-基	4-NO ₂	2-CH ₃	H
I. 1. 1596	吡啶-3-基	4-NO ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 1597	吡啶-3-基	4-NO ₂	6-CH ₃	H

I. 1. 1598	吡啶-3-基	4-NO ₂	2-CF ₃	H
I. 1. 1599	吡啶-3-基	4-NO ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 1600	吡啶-3-基	4-NO ₂	6-CF ₃	H
I. 1. 1601	吡啶-3-基	4-NO ₂	2-乙烯基	H
I. 1. 1602	吡啶-3-基	4-NO ₂	5-乙烯基	H
I. 1. 1603	吡啶-3-基	4-NO ₂	6-乙烯基	H
I. 1. 1604	吡啶-3-基	4-NO ₂	2-Cl	6-F
I. 1. 1605	吡啶-3-基	4-NO ₂	5-Cl	6-F
I. 1. 1606	吡啶-3-基	4-CN	2-Cl	5-F
I. 1. 1607	吡啶-3-基	4-CN	2-Cl	H
I. 1. 1608	吡啶-3-基	4-CN	5-Cl	H
I. 1. 1609	吡啶-3-基	4-CN	6-Cl	H
I. 1. 1610	吡啶-3-基	4-CN	2-F	H
I. 1. 1611	吡啶-3-基	4-CN	5-F	H
I. 1. 1612	吡啶-3-基	4-CN	6-F	H
I. 1. 1613	吡啶-3-基	4-CN	2-Br	H
I. 1. 1614	吡啶-3-基	4-CN	5-Br	H
I. 1. 1615	吡啶-3-基	4-CN	6-Br	H
I. 1. 1616	吡啶-3-基	4-CN	2-CH ₃	H
I. 1. 1617	吡啶-3-基	4-CN	5-CH ₃	H
I. 1. 1618	吡啶-3-基	4-CN	6-CH ₃	H
I. 1. 1619	吡啶-3-基	4-CN	2-CF ₃	H
I. 1. 1620	吡啶-3-基	4-CN	5-CF ₃	H

[0191]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1621	吡啶 -3- 基	4-CN	6-CF ₃	H
I. 1. 1622	吡啶 -3- 基	4-CN	2- 乙烯基	H
I. 1. 1623	吡啶 -3- 基	4-CN	5- 乙烯基	H
I. 1. 1624	吡啶 -3- 基	4-CN	6- 乙烯基	H
I. 1. 1625	吡啶 -3- 基	4-CN	2-Cl	6-F
I. 1. 1626	吡啶 -3- 基	4-CN	5-Cl	6-F
I. 1. 1627	吡啶 -3- 基	4-Br	2-Cl	5-F
I. 1. 1628	吡啶 -3- 基	4-Br	2-Cl	H
I. 1. 1629	吡啶 -3- 基	4-Br	5-Cl	H
I. 1. 1630	吡啶 -3- 基	4-Br	6-Cl	H
I. 1. 1631	吡啶 -3- 基	4-Br	2-F	H
I. 1. 1632	吡啶 -3- 基	4-Br	5-F	H
I. 1. 1633	吡啶 -3- 基	4-Br	6-F	H
I. 1. 1634	吡啶 -3- 基	4-Br	2-Br	H
I. 1. 1635	吡啶 -3- 基	4-Br	5-Br	H
I. 1. 1636	吡啶 -3- 基	4-Br	6-Br	H
I. 1. 1637	吡啶 -3- 基	4-Br	2-CH ₃	H
I. 1. 1638	吡啶 -3- 基	4-Br	5-CH ₃	H
I. 1. 1639	吡啶 -3- 基	4-Br	6-CH ₃	H
I. 1. 1640	吡啶 -3- 基	4-Br	2-CF ₃	H
I. 1. 1641	吡啶 -3- 基	4-Br	5-CF ₃	H
I. 1. 1642	吡啶 -3- 基	4-Br	6-CF ₃	H
I. 1. 1643	吡啶 -3- 基	4-Br	2- 乙烯基	H

I. 1. 1644	吡啶-3-基	4-Br	5-乙烯基	H
I. 1. 1645	吡啶-3-基	4-Br	6-乙烯基	H
I. 1. 1646	吡啶-3-基	4-Br	2-Cl	6-F
I. 1. 1647	吡啶-3-基	4-Br	5-Cl	6-F
I. 1. 1648	吡啶-3-基	4-Cl	2-Cl	5-F
I. 1. 1649	吡啶-3-基	4-Cl	2-Cl	H
I. 1. 1650	吡啶-3-基	4-Cl	5-Cl	H
I. 1. 1651	吡啶-3-基	4-Cl	6-Cl	H
I. 1. 1652	吡啶-3-基	4-Cl	2-F	H
I. 1. 1653	吡啶-3-基	4-Cl	5-F	H
I. 1. 1654	吡啶-3-基	4-Cl	6-F	H
I. 1. 1655	吡啶-3-基	4-Cl	2-Br	H
I. 1. 1656	吡啶-3-基	4-Cl	5-Br	H

[0192]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1657	吡啶-3-基	4-Cl	6-Br	H
I. 1. 1658	吡啶-3-基	4-Cl	2-CH ₃	H
I. 1. 1659	吡啶-3-基	4-Cl	5-CH ₃	H
I. 1. 1660	吡啶-3-基	4-Cl	6-CH ₃	H
I. 1. 1661	吡啶-3-基	4-Cl	2-CF ₃	H
I. 1. 1662	吡啶-3-基	4-Cl	5-CF ₃	H
I. 1. 1663	吡啶-3-基	4-Cl	6-CF ₃	H
I. 1. 1664	吡啶-3-基	4-Cl	2-乙烯基	H
I. 1. 1665	吡啶-3-基	4-Cl	5-乙烯基	H

I. 1. 1666	吡啶-3-基	4-Cl	6-乙烯基	H
I. 1. 1667	吡啶-3-基	4-Cl	2-Cl	6-F
I. 1. 1668	吡啶-3-基	4-Cl	5-Cl	6-F
I. 1. 1669	吡啶-3-基	4-乙炔基	2-Cl	5-F
I. 1. 1670	吡啶-3-基	4-乙炔基	2-Cl	H
I. 1. 1671	吡啶-3-基	4-乙炔基	5-Cl	H
I. 1. 1672	吡啶-3-基	4-乙炔基	6-Cl	H
I. 1. 1673	吡啶-3-基	4-乙炔基	2-F	H
I. 1. 1674	吡啶-3-基	4-乙炔基	5-F	H
I. 1. 1675	吡啶-3-基	4-乙炔基	6-F	H
I. 1. 1676	吡啶-3-基	4-乙炔基	2-Br	H
I. 1. 1677	吡啶-3-基	4-乙炔基	5-Br	H
I. 1. 1678	吡啶-3-基	4-乙炔基	6-Br	H
I. 1. 1679	吡啶-3-基	4-乙炔基	2-CH ₃	H
I. 1. 1680	吡啶-3-基	4-乙炔基	5-CH ₃	H
I. 1. 1681	吡啶-3-基	4-乙炔基	6-CH ₃	H
I. 1. 1682	吡啶-3-基	4-乙炔基	2-CF ₃	H
I. 1. 1683	吡啶-3-基	4-乙炔基	5-CF ₃	H
I. 1. 1684	吡啶-3-基	4-乙炔基	6-CF ₃	H
I. 1. 1685	吡啶-3-基	4-乙炔基	2-乙烯基	H
I. 1. 1686	吡啶-3-基	4-乙炔基	5-乙烯基	H
I. 1. 1687	吡啶-3-基	4-乙炔基	6-乙烯基	H
I. 1. 1688	吡啶-3-基	4-乙炔基	2-Cl	6-F
I. 1. 1689	吡啶-3-基	4-乙炔基	5-Cl	6-F

I. 1. 1690	吡啶-3-基	4-I	2-Cl	5-F
I. 1. 1691	吡啶-3-基	4-I	2-Cl	H
I. 1. 1692	吡啶-3-基	4-I	5-Cl	H

[0193]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1693	吡啶-3-基	4-I	6-Cl	H
I. 1. 1694	吡啶-3-基	4-I	2-F	H
I. 1. 1695	吡啶-3-基	4-I	5-F	H
I. 1. 1696	吡啶-3-基	4-I	6-F	H
I. 1. 1697	吡啶-3-基	4-I	2-Br	H
I. 1. 1698	吡啶-3-基	4-I	5-Br	H
I. 1. 1699	吡啶-3-基	4-I	6-Br	H
I. 1. 1700	吡啶-3-基	4-I	2-CH ₃	H
I. 1. 1701	吡啶-3-基	4-I	5-CH ₃	H
I. 1. 1702	吡啶-3-基	4-I	6-CH ₃	H
I. 1. 1703	吡啶-3-基	4-I	2-CF ₃	H
I. 1. 1704	吡啶-3-基	4-I	5-CF ₃	H
I. 1. 1705	吡啶-3-基	4-I	6-CF ₃	H
I. 1. 1706	吡啶-3-基	4-I	2-乙烯基	H
I. 1. 1707	吡啶-3-基	4-I	5-乙烯基	H
I. 1. 1708	吡啶-3-基	4-I	6-乙烯基	H
I. 1. 1709	吡啶-3-基	4-I	2-Cl	6-F
I. 1. 1710	吡啶-3-基	4-I	5-Cl	6-F
I. 1. 1711	吡啶-3-基	4-COOH	2-Cl	5-F

I. 1. 1712	吡啶-3-基	4-COOH	2-Cl	H
I. 1. 1713	吡啶-3-基	4-COOH	5-Cl	H
I. 1. 1714	吡啶-3-基	4-COOH	6-Cl	H
I. 1. 1715	吡啶-3-基	4-COOH	2-F	H
I. 1. 1716	吡啶-3-基	4-COOH	5-F	H
I. 1. 1717	吡啶-3-基	4-COOH	6-F	H
I. 1. 1718	吡啶-3-基	4-COOH	2-Br	H
I. 1. 1719	吡啶-3-基	4-COOH	5-Br	H
I. 1. 1720	吡啶-3-基	4-COOH	6-Br	H
I. 1. 1721	吡啶-3-基	4-COOH	2-CH ₃	H
I. 1. 1722	吡啶-3-基	4-COOH	5-CH ₃	H
I. 1. 1723	吡啶-3-基	4-COOH	6-CH ₃	H
I. 1. 1724	吡啶-3-基	4-COOH	2-CF ₃	H
I. 1. 1725	吡啶-3-基	4-COOH	5-CF ₃	H
I. 1. 1726	吡啶-3-基	4-COOH	6-CF ₃	H
I. 1. 1727	吡啶-3-基	4-COOH	2-乙烯基	H
I. 1. 1728	吡啶-3-基	4-COOH	5-乙烯基	H

[0194]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1729	吡啶-3-基	4-COOH	6-乙烯基	H
I. 1. 1730	吡啶-3-基	4-COOH	2-Cl	6-F
I. 1. 1731	吡啶-3-基	4-COOH	5-Cl	6-F
I. 1. 1732	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	2-Cl	5-F
I. 1. 1733	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	2-Cl	H

I. 1. 1734	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 1735	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	6-Cl	H
I. 1. 1736	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	2-F	H
I. 1. 1737	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	5-F	H
I. 1. 1738	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	6-F	H
I. 1. 1739	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	2-Br	H
I. 1. 1740	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	5-Br	H
I. 1. 1741	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	6-Br	H
I. 1. 1742	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	2-CH ₃	H
I. 1. 1743	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 1744	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	6-CH ₃	H
I. 1. 1745	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	2-CF ₃	H
I. 1. 1746	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 1747	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	6-CF ₃	H
I. 1. 1748	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	2-乙烯基	H
I. 1. 1749	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	5-乙烯基	H
I. 1. 1750	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	6-乙烯基	H
I. 1. 1751	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	2-Cl	6-F
I. 1. 1752	吡啶-3-基	4-COOCH ₃	5-Cl	6-F
I. 1. 1753	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-Cl	5-F
I. 1. 1754	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-Cl	H
I. 1. 1755	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	H
I. 1. 1756	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	6-Cl	H
I. 1. 1757	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-F	H

I. 1. 1758	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-F	H
I. 1. 1759	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	6-F	H
I. 1. 1760	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-Br	H
I. 1. 1761	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-Br	H
I. 1. 1762	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	6-Br	H
I. 1. 1763	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-CH ₃	H
I. 1. 1764	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	H

[0195]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1765	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	6-CH ₃	H
I. 1. 1766	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-CF ₃	H
I. 1. 1767	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 1768	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	6-CF ₃	H
I. 1. 1769	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-乙烯基	H
I. 1. 1770	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-乙烯基	H
I. 1. 1771	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	6-乙烯基	H
I. 1. 1772	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-Cl	6-F
I. 1. 1773	吡啶-3-基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	6-F
I. 1. 1774	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	2-Cl	5-F
I. 1. 1775	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	2-Cl	H
I. 1. 1776	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 1777	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	6-Cl	H
I. 1. 1778	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	2-F	H
I. 1. 1779	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	5-F	H

I. 1. 1780	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	6-F	H
I. 1. 1781	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	2-Br	H
I. 1. 1782	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	5-Br	H
I. 1. 1783	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	6-Br	H
I. 1. 1784	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	2-CH ₃	H
I. 1. 1785	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 1786	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	6-CH ₃	H
I. 1. 1787	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	2-CF ₃	H
I. 1. 1788	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 1789	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	6-CF ₃	H
I. 1. 1790	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	2-乙烯基	H
I. 1. 1791	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	5-乙烯基	H
I. 1. 1792	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	6-乙烯基	H
I. 1. 1793	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	2-Cl	6-F
I. 1. 1794	吡啶-3-基	4-CONHCH ₃	5-Cl	6-F
I. 1. 1795	吡啶-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	2-Cl	5-F
I. 1. 1796	吡啶-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	2-Cl	H
I. 1. 1797	吡啶-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	H
I. 1. 1798	吡啶-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	6-Cl	H
I. 1. 1799	吡啶-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	2-F	H
I. 1. 1800	吡啶-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	5-F	H

[0196]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1801	吡啶-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	6-F	H

I. 1. 1802	吡啶-3-基	$4\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	2-Br	H
I. 1. 1803	吡啶-3-基	$4\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-Br	H
I. 1. 1804	吡啶-3-基	$4\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	6-Br	H
I. 1. 1805	吡啶-3-基	$4\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	2-CH ₃	H
I. 1. 1806	吡啶-3-基	$4\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-CH ₃	H
I. 1. 1807	吡啶-3-基	$4\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	6-CH ₃	H
I. 1. 1808	吡啶-3-基	$4\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	2-CF ₃	H
I. 1. 1809	吡啶-3-基	$4\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-CF ₃	H
I. 1. 1810	吡啶-3-基	$4\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	6-CF ₃	H
I. 1. 1811	吡啶-3-基	$4\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	2-乙烯基	H
I. 1. 1812	吡啶-3-基	$4\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-乙烯基	H
I. 1. 1813	吡啶-3-基	$4\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	6-乙烯基	H
I. 1. 1814	吡啶-3-基	$4\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	2-Cl	6-F
I. 1. 1815	吡啶-3-基	$4\text{-CON}(\text{CH}_3)_2$	5-Cl	6-F
I. 1. 1816	吡啶-4-基	3-NO ₂	2-Cl	5-F
I. 1. 1817	吡啶-4-基	3-NO ₂	2-Cl	H
I. 1. 1818	吡啶-4-基	3-NO ₂	5-Cl	H
I. 1. 1819	吡啶-4-基	3-NO ₂	6-Cl	H
I. 1. 1820	吡啶-4-基	3-NO ₂	2-F	H
I. 1. 1821	吡啶-4-基	3-NO ₂	5-F	H
I. 1. 1822	吡啶-4-基	3-NO ₂	6-F	H
I. 1. 1823	吡啶-4-基	3-NO ₂	2-Br	H
I. 1. 1824	吡啶-4-基	3-NO ₂	5-Br	H
I. 1. 1825	吡啶-4-基	3-NO ₂	6-Br	H

I. 1. 1826	吡啶-4-基	3-NO ₂	2-CH ₃	H
I. 1. 1827	吡啶-4-基	3-NO ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 1828	吡啶-4-基	3-NO ₂	6-CH ₃	H
I. 1. 1829	吡啶-4-基	3-NO ₂	2-CF ₃	H
I. 1. 1830	吡啶-4-基	3-NO ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 1831	吡啶-4-基	3-NO ₂	6-CF ₃	H
I. 1. 1832	吡啶-4-基	3-NO ₂	2-乙烯基	H
I. 1. 1833	吡啶-4-基	3-NO ₂	5-乙烯基	H
I. 1. 1834	吡啶-4-基	3-NO ₂	6-乙烯基	H
I. 1. 1835	吡啶-4-基	3-NO ₂	2-Cl	6-F
I. 1. 1836	吡啶-4-基	3-NO ₂	5-Cl	6-F

[0197]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1837	吡啶-4-基	3-CN	2-Cl	5-F
I. 1. 1838	吡啶-4-基	3-CN	2-Cl	H
I. 1. 1839	吡啶-4-基	3-CN	5-Cl	H
I. 1. 1840	吡啶-4-基	3-CN	6-Cl	H
I. 1. 1841	吡啶-4-基	3-CN	2-F	H
I. 1. 1842	吡啶-4-基	3-CN	5-F	H
I. 1. 1843	吡啶-4-基	3-CN	6-F	H
I. 1. 1844	吡啶-4-基	3-CN	2-Br	H
I. 1. 1845	吡啶-4-基	3-CN	5-Br	H
I. 1. 1846	吡啶-4-基	3-CN	6-Br	H
I. 1. 1847	吡啶-4-基	3-CN	2-CH ₃	H

I. 1. 1848	吡啶-4-基	3-CN	5-CH ₃	H
I. 1. 1849	吡啶-4-基	3-CN	6-CH ₃	H
I. 1. 1850	吡啶-4-基	3-CN	2-CF ₃	H
I. 1. 1851	吡啶-4-基	3-CN	5-CF ₃	H
I. 1. 1852	吡啶-4-基	3-CN	6-CF ₃	H
I. 1. 1853	吡啶-4-基	3-CN	2-乙烯基	H
I. 1. 1854	吡啶-4-基	3-CN	5-乙烯基	H
I. 1. 1855	吡啶-4-基	3-CN	6-乙烯基	H
I. 1. 1856	吡啶-4-基	3-CN	2-Cl	6-F
I. 1. 1857	吡啶-4-基	3-CN	5-Cl	6-F
I. 1. 1858	吡啶-4-基	3-Br	2-Cl	5-F
I. 1. 1859	吡啶-4-基	3-Br	2-Cl	H
I. 1. 1860	吡啶-4-基	3-Br	5-Cl	H
I. 1. 1861	吡啶-4-基	3-Br	6-Cl	H
I. 1. 1862	吡啶-4-基	3-Br	2-F	H
I. 1. 1863	吡啶-4-基	3-Br	5-F	H
I. 1. 1864	吡啶-4-基	3-Br	6-F	H
I. 1. 1865	吡啶-4-基	3-Br	2-Br	H
I. 1. 1866	吡啶-4-基	3-Br	5-Br	H
I. 1. 1867	吡啶-4-基	3-Br	6-Br	H
I. 1. 1868	吡啶-4-基	3-Br	2-CH ₃	H
I. 1. 1869	吡啶-4-基	3-Br	5-CH ₃	H
I. 1. 1870	吡啶-4-基	3-Br	6-CH ₃	H
I. 1. 1871	吡啶-4-基	3-Br	2-CF ₃	H

I. 1. 1872	吡啶-4-基	3-Br	5-CF ₃	H
------------	--------	------	-------------------	---

[0198]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1873	吡啶-4-基	3-Br	6-CF ₃	H
I. 1. 1874	吡啶-4-基	3-Br	2-乙烯基	H
I. 1. 1875	吡啶-4-基	3-Br	5-乙烯基	H
I. 1. 1876	吡啶-4-基	3-Br	6-乙烯基	H
I. 1. 1877	吡啶-4-基	3-Br	2-Cl	6-F
I. 1. 1878	吡啶-4-基	3-Br	5-Cl	6-F
I. 1. 1879	吡啶-4-基	3-Cl	2-Cl	5-F
I. 1. 1880	吡啶-4-基	3-Cl	2-Cl	H
I. 1. 1881	吡啶-4-基	3-Cl	5-Cl	H
I. 1. 1882	吡啶-4-基	3-Cl	6-Cl	H
I. 1. 1883	吡啶-4-基	3-Cl	2-F	H
I. 1. 1884	吡啶-4-基	3-Cl	5-F	H
I. 1. 1885	吡啶-4-基	3-Cl	6-F	H
I. 1. 1886	吡啶-4-基	3-Cl	2-Br	H
I. 1. 1887	吡啶-4-基	3-Cl	5-Br	H
I. 1. 1888	吡啶-4-基	3-Cl	6-Br	H
I. 1. 1889	吡啶-4-基	3-Cl	2-CH ₃	H
I. 1. 1890	吡啶-4-基	3-Cl	5-CH ₃	H
I. 1. 1891	吡啶-4-基	3-Cl	6-CH ₃	H
I. 1. 1892	吡啶-4-基	3-Cl	2-CF ₃	H
I. 1. 1893	吡啶-4-基	3-Cl	5-CF ₃	H

I. 1. 1894	吡啶-4-基	3-Cl	6-CF ₃	H
I. 1. 1895	吡啶-4-基	3-Cl	2-乙烯基	H
I. 1. 1896	吡啶-4-基	3-Cl	5-乙烯基	H
I. 1. 1897	吡啶-4-基	3-Cl	6-乙烯基	H
I. 1. 1898	吡啶-4-基	3-Cl	2-Cl	6-F
I. 1. 1899	吡啶-4-基	3-Cl	5-Cl	6-F
I. 1. 1900	吡啶-4-基	3-乙炔基	2-Cl	5-F
I. 1. 1901	吡啶-4-基	3-乙炔基	2-Cl	H
I. 1. 1902	吡啶-4-基	3-乙炔基	5-Cl	H
I. 1. 1903	吡啶-4-基	3-乙炔基	6-Cl	H
I. 1. 1904	吡啶-4-基	3-乙炔基	2-F	H
I. 1. 1905	吡啶-4-基	3-乙炔基	5-F	H
I. 1. 1906	吡啶-4-基	3-乙炔基	6-F	H
I. 1. 1907	吡啶-4-基	3-乙炔基	2-Br	H
I. 1. 1908	吡啶-4-基	3-乙炔基	5-Br	H

[0199]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1909	吡啶-4-基	3-乙炔基	6-Br	H
I. 1. 1910	吡啶-4-基	3-乙炔基	2-CH ₃	H
I. 1. 1911	吡啶-4-基	3-乙炔基	5-CH ₃	H
I. 1. 1912	吡啶-4-基	3-乙炔基	6-CH ₃	H
I. 1. 1913	吡啶-4-基	3-乙炔基	2-CF ₃	H
I. 1. 1914	吡啶-4-基	3-乙炔基	5-CF ₃	H
I. 1. 1915	吡啶-4-基	3-乙炔基	6-CF ₃	H

I. 1. 1916	吡啶-4-基	3-乙炔基	2-乙烯基	H
I. 1. 1917	吡啶-4-基	3-乙炔基	5-乙烯基	H
I. 1. 1918	吡啶-4-基	3-乙炔基	6-乙烯基	H
I. 1. 1919	吡啶-4-基	3-乙炔基	2-Cl	6-F
I. 1. 1920	吡啶-4-基	3-乙炔基	5-Cl	6-F
I. 1. 1921	吡啶-4-基	3-I	2-Cl	5-F
I. 1. 1922	吡啶-4-基	3-I	2-Cl	H
I. 1. 1923	吡啶-4-基	3-I	5-Cl	H
I. 1. 1924	吡啶-4-基	3-I	6-Cl	H
I. 1. 1925	吡啶-4-基	3-I	2-F	H
I. 1. 1926	吡啶-4-基	3-I	5-F	H
I. 1. 1927	吡啶-4-基	3-I	6-F	H
I. 1. 1928	吡啶-4-基	3-I	2-Br	H
I. 1. 1929	吡啶-4-基	3-I	5-Br	H
I. 1. 1930	吡啶-4-基	3-I	6-Br	H
I. 1. 1931	吡啶-4-基	3-I	2-CH ₃	H
I. 1. 1932	吡啶-4-基	3-I	5-CH ₃	H
I. 1. 1933	吡啶-4-基	3-I	6-CH ₃	H
I. 1. 1934	吡啶-4-基	3-I	2-CF ₃	H
I. 1. 1935	吡啶-4-基	3-I	5-CF ₃	H
I. 1. 1936	吡啶-4-基	3-I	6-CF ₃	H
I. 1. 1937	吡啶-4-基	3-I	2-乙烯基	H
I. 1. 1938	吡啶-4-基	3-I	5-乙烯基	H
I. 1. 1939	吡啶-4-基	3-I	6-乙烯基	H

I. 1. 1940	吡啶-4-基	3-I	2-Cl	6-F
I. 1. 1941	吡啶-4-基	3-I	5-Cl	6-F
I. 1. 1942	吡啶-4-基	3-COOH	2-Cl	5-F
I. 1. 1943	吡啶-4-基	3-COOH	2-Cl	H
I. 1. 1944	吡啶-4-基	3-COOH	5-Cl	H

[0200]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1945	吡啶-4-基	3-COOH	6-Cl	H
I. 1. 1946	吡啶-4-基	3-COOH	2-F	H
I. 1. 1947	吡啶-4-基	3-COOH	5-F	H
I. 1. 1948	吡啶-4-基	3-COOH	6-F	H
I. 1. 1949	吡啶-4-基	3-COOH	2-Br	H
I. 1. 1950	吡啶-4-基	3-COOH	5-Br	H
I. 1. 1951	吡啶-4-基	3-COOH	6-Br	H
I. 1. 1952	吡啶-4-基	3-COOH	2-CH ₃	H
I. 1. 1953	吡啶-4-基	3-COOH	5-CH ₃	H
I. 1. 1954	吡啶-4-基	3-COOH	6-CH ₃	H
I. 1. 1955	吡啶-4-基	3-COOH	2-CF ₃	H
I. 1. 1956	吡啶-4-基	3-COOH	5-CF ₃	H
I. 1. 1957	吡啶-4-基	3-COOH	6-CF ₃	H
I. 1. 1958	吡啶-4-基	3-COOH	2-乙烯基	H
I. 1. 1959	吡啶-4-基	3-COOH	5-乙烯基	H
I. 1. 1960	吡啶-4-基	3-COOH	6-乙烯基	H
I. 1. 1961	吡啶-4-基	3-COOH	2-Cl	6-F

I. 1. 1962	吡啶 -4- 基	3-COOH	5-Cl	6-F
I. 1. 1963	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	2-Cl	5-F
I. 1. 1964	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	2-Cl	H
I. 1. 1965	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 1966	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	6-Cl	H
I. 1. 1967	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	2-F	H
I. 1. 1968	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	5-F	H
I. 1. 1969	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	6-F	H
I. 1. 1970	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	2-Br	H
I. 1. 1971	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	5-Br	H
I. 1. 1972	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	6-Br	H
I. 1. 1973	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	2-CH ₃	H
I. 1. 1974	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 1975	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	6-CH ₃	H
I. 1. 1976	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	2-CF ₃	H
I. 1. 1977	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 1978	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	6-CF ₃	H
I. 1. 1979	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	2- 乙烯基	H
I. 1. 1980	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	5- 乙烯基	H

[0201]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 1981	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	6- 乙烯基	H
I. 1. 1982	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	2-Cl	6-F
I. 1. 1983	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₃	5-Cl	6-F

I. 1. 1984	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	2-Cl	5-F
I. 1. 1985	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	2-Cl	H
I. 1. 1986	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	H
I. 1. 1987	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	6-Cl	H
I. 1. 1988	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	2-F	H
I. 1. 1989	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-F	H
I. 1. 1990	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	6-F	H
I. 1. 1991	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	2-Br	H
I. 1. 1992	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-Br	H
I. 1. 1993	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	6-Br	H
I. 1. 1994	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	2-CH ₃	H
I. 1. 1995	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 1996	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	6-CH ₃	H
I. 1. 1997	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	2-CF ₃	H
I. 1. 1998	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 1999	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	6-CF ₃	H
I. 1. 2000	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	2- 乙烯基	H
I. 1. 2001	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5- 乙烯基	H
I. 1. 2002	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	6- 乙烯基	H
I. 1. 2003	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	2-Cl	6-F
I. 1. 2004	吡啶 -4- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	6-F
I. 1. 2005	吡啶 -4- 基	3-CONHCH ₃	2-Cl	5-F
I. 1. 2006	吡啶 -4- 基	3-CONHCH ₃	2-Cl	H
I. 1. 2007	吡啶 -4- 基	3-CONHCH ₃	5-Cl	H

I. 1. 2008	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	6-Cl	H
I. 1. 2009	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	2-F	H
I. 1. 2010	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	5-F	H
I. 1. 2011	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	6-F	H
I. 1. 2012	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	2-Br	H
I. 1. 2013	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	5-Br	H
I. 1. 2014	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	6-Br	H
I. 1. 2015	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	2-CH ₃	H
I. 1. 2016	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	5-CH ₃	H

[0202]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2017	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	6-CH ₃	H
I. 1. 2018	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	2-CF ₃	H
I. 1. 2019	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2020	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	6-CF ₃	H
I. 1. 2021	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	2-乙烯基	H
I. 1. 2022	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	5-乙烯基	H
I. 1. 2023	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	6-乙烯基	H
I. 1. 2024	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	2-Cl	6-F
I. 1. 2025	吡啶-4-基	3-CONHCH ₃	5-Cl	6-F
I. 1. 2026	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	2-Cl	5-F
I. 1. 2027	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	2-Cl	H
I. 1. 2028	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	H
I. 1. 2029	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	6-Cl	H

I. 1. 2030	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	2-F	H
I. 1. 2031	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	5-F	H
I. 1. 2032	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	6-F	H
I. 1. 2033	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	2-Br	H
I. 1. 2034	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	5-Br	H
I. 1. 2035	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	6-Br	H
I. 1. 2036	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	2-CH ₃	H
I. 1. 2037	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 2038	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	6-CH ₃	H
I. 1. 2039	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	2-CF ₃	H
I. 1. 2040	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 2041	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	6-CF ₃	H
I. 1. 2042	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	2-乙烯基	H
I. 1. 2043	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	5-乙烯基	H
I. 1. 2044	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	6-乙烯基	H
I. 1. 2045	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	2-Cl	6-F
I. 1. 2046	吡啶-4-基	3-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	6-F
I. 1. 2047	呋喃-2-基	3-NO ₂	4-Cl	5-F
I. 1. 2048	呋喃-2-基	3-NO ₂	4-Cl	H
I. 1. 2049	呋喃-2-基	3-NO ₂	5-Cl	H
I. 1. 2050	呋喃-2-基	3-NO ₂	4-F	H
I. 1. 2051	呋喃-2-基	3-NO ₂	5-F	H
I. 1. 2052	呋喃-2-基	3-NO ₂	4-CH ₃	H

[0203]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2053	呋喃 -2- 基	3-NO ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 2054	呋喃 -2- 基	3-NO ₂	4-CN	H
I. 1. 2055	呋喃 -2- 基	3-NO ₂	5-CN	H
I. 1. 2056	呋喃 -2- 基	3-NO ₂	4-CF ₃	H
I. 1. 2057	呋喃 -2- 基	3-NO ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 2058	呋喃 -2- 基	3-CN	4-Cl	5-F
I. 1. 2059	呋喃 -2- 基	3-CN	4-Cl	H
I. 1. 2060	呋喃 -2- 基	3-CN	5-Cl	H
I. 1. 2061	呋喃 -2- 基	3-CN	4-F	H
I. 1. 2062	呋喃 -2- 基	3-CN	5-F	H
I. 1. 2063	呋喃 -2- 基	3-CN	4-CH ₃	H
I. 1. 2064	呋喃 -2- 基	3-CN	5-CH ₃	H
I. 1. 2065	呋喃 -2- 基	3-CN	4-CN	H
I. 1. 2066	呋喃 -2- 基	3-CN	5-CN	H
I. 1. 2067	呋喃 -2- 基	3-CN	4-CF ₃	H
I. 1. 2068	呋喃 -2- 基	3-CN	5-CF ₃	H
I. 1. 2069	呋喃 -2- 基	3-COOH	4-Cl	5-F
I. 1. 2070	呋喃 -2- 基	3-COOH	4-Cl	H
I. 1. 2071	呋喃 -2- 基	3-COOH	5-Cl	H
I. 1. 2072	呋喃 -2- 基	3-COOH	4-F	H
I. 1. 2073	呋喃 -2- 基	3-COOH	5-F	H
I. 1. 2074	呋喃 -2- 基	3-COOH	4-CH ₃	H
I. 1. 2075	呋喃 -2- 基	3-COOH	5-CH ₃	H

I. 1. 2076	呋喃 -2- 基	3-COOH	4-CN	H
I. 1. 2077	呋喃 -2- 基	3-COOH	5-CN	H
I. 1. 2078	呋喃 -2- 基	3-COOH	4-CF ₃	H
I. 1. 2079	呋喃 -2- 基	3-COOH	5-CF ₃	H
I. 1. 2080	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 2081	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₃	4-Cl	H
I. 1. 2082	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2083	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₃	4-F	H
I. 1. 2084	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₃	5-F	H
I. 1. 2085	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 2086	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2087	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₃	4-CN	H
I. 1. 2088	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₃	5-CN	H

[0204]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2089	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 2090	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2091	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 2092	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	H
I. 1. 2093	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2094	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-F	H
I. 1. 2095	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-F	H
I. 1. 2096	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 2097	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	H

I. 1. 2098	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-CN	H
I. 1. 2099	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-CN	H
I. 1. 2100	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 2101	呋喃 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2102	呋喃 -2- 基	3- 乙炔基	4-Cl	5-F
I. 1. 2103	呋喃 -2- 基	3- 乙炔基	4-Cl	H
I. 1. 2104	呋喃 -2- 基	3- 乙炔基	5-Cl	H
I. 1. 2105	呋喃 -2- 基	3- 乙炔基	4-F	H
I. 1. 2106	呋喃 -2- 基	3- 乙炔基	5-F	H
I. 1. 2107	呋喃 -2- 基	3- 乙炔基	4-CH ₃	H
I. 1. 2108	呋喃 -2- 基	3- 乙炔基	5-CH ₃	H
I. 1. 2109	呋喃 -2- 基	3- 乙炔基	4-CN	H
I. 1. 2110	呋喃 -2- 基	3- 乙炔基	5-CN	H
I. 1. 2111	呋喃 -2- 基	3- 乙炔基	4-CF ₃	H
I. 1. 2112	呋喃 -2- 基	3- 乙炔基	5-CF ₃	H
I. 1. 2113	呋喃 -2- 基	3-I	4-Cl	5-F
I. 1. 2114	呋喃 -2- 基	3-I	4-Cl	H
I. 1. 2115	呋喃 -2- 基	3-I	5-Cl	H
I. 1. 2116	呋喃 -2- 基	3-I	4-F	H
I. 1. 2117	呋喃 -2- 基	3-I	5-F	H
I. 1. 2118	呋喃 -2- 基	3-I	4-CH ₃	H
I. 1. 2119	呋喃 -2- 基	3-I	5-CH ₃	H
I. 1. 2120	呋喃 -2- 基	3-I	4-CN	H
I. 1. 2121	呋喃 -2- 基	3-I	5-CN	H

I. 1. 2122	呋喃 -2- 基	3-I	4-CF ₃	H
I. 1. 2123	呋喃 -2- 基	3-I	5-CF ₃	H
I. 1. 2124	呋喃 -2- 基	3-Cl	4-Cl	5-F

[0205]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2125	呋喃 -2- 基	3-Cl	4-Cl	H
I. 1. 2126	呋喃 -2- 基	3-Cl	5-Cl	H
I. 1. 2127	呋喃 -2- 基	3-Cl	4-F	H
I. 1. 2128	呋喃 -2- 基	3-Cl	5-F	H
I. 1. 2129	呋喃 -2- 基	3-Cl	4-CH ₃	H
I. 1. 2130	呋喃 -2- 基	3-Cl	5-CH ₃	H
I. 1. 2131	呋喃 -2- 基	3-Cl	4-CN	H
I. 1. 2132	呋喃 -2- 基	3-Cl	5-CN	H
I. 1. 2133	呋喃 -2- 基	3-Cl	4-CF ₃	H
I. 1. 2134	呋喃 -2- 基	3-Cl	5-CF ₃	H
I. 1. 2135	呋喃 -2- 基	3-Br	4-Cl	5-F
I. 1. 2136	呋喃 -2- 基	3-Br	4-Cl	H
I. 1. 2137	呋喃 -2- 基	3-Br	5-Cl	H
I. 1. 2138	呋喃 -2- 基	3-Br	4-F	H
I. 1. 2139	呋喃 -2- 基	3-Br	5-F	H
I. 1. 2140	呋喃 -2- 基	3-Br	4-CH ₃	H
I. 1. 2141	呋喃 -2- 基	3-Br	5-CH ₃	H
I. 1. 2142	呋喃 -2- 基	3-Br	4-CN	H
I. 1. 2143	呋喃 -2- 基	3-Br	5-CN	H

I. 1. 2144	呋喃 -2- 基	3-Br	4-CF ₃	H
I. 1. 2145	呋喃 -2- 基	3-Br	5-CF ₃	H
I. 1. 2146	呋喃 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-Cl	5-F
I. 1. 2147	呋喃 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-Cl	H
I. 1. 2148	呋喃 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	H
I. 1. 2149	呋喃 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-F	H
I. 1. 2150	呋喃 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-F	H
I. 1. 2151	呋喃 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-CH ₃	H
I. 1. 2152	呋喃 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 2153	呋喃 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-CN	H
I. 1. 2154	呋喃 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-CN	H
I. 1. 2155	呋喃 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-CF ₃	H
I. 1. 2156	呋喃 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 2157	呋喃 -2- 基	3-CONHCH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 2158	呋喃 -2- 基	3-CONHCH ₃	4-Cl	H
I. 1. 2159	呋喃 -2- 基	3-CONHCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2160	呋喃 -2- 基	3-CONHCH ₃	4-F	H

[0206]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2161	呋喃 -2- 基	3-CONHCH ₃	5-F	H
I. 1. 2162	呋喃 -2- 基	3-CONHCH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 2163	呋喃 -2- 基	3-CONHCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2164	呋喃 -2- 基	3-CONHCH ₃	4-CN	H
I. 1. 2165	呋喃 -2- 基	3-CONHCH ₃	5-CN	H

I. 1. 2166	呋喃 -2- 基	3-CONHCH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 2167	呋喃 -2- 基	3-CONHCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2168	呋喃 -3- 基	2-NO ₂	4-Cl	5-F
I. 1. 2169	呋喃 -3- 基	2-NO ₂	4-Cl	H
I. 1. 2170	呋喃 -3- 基	2-NO ₂	5-Cl	H
I. 1. 2171	呋喃 -3- 基	2-NO ₂	4-F	H
I. 1. 2172	呋喃 -3- 基	2-NO ₂	5-F	H
I. 1. 2173	呋喃 -3- 基	2-NO ₂	4-CH ₃	H
I. 1. 2174	呋喃 -3- 基	2-NO ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 2175	呋喃 -3- 基	2-NO ₂	4-CN	H
I. 1. 2176	呋喃 -3- 基	2-NO ₂	5-CN	H
I. 1. 2177	呋喃 -3- 基	2-NO ₂	4-CF ₃	H
I. 1. 2178	呋喃 -3- 基	2-NO ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 2179	呋喃 -3- 基	2-CN	4-Cl	5-F
I. 1. 2180	呋喃 -3- 基	2-CN	4-Cl	H
I. 1. 2181	呋喃 -3- 基	2-CN	5-Cl	H
I. 1. 2182	呋喃 -3- 基	2-CN	4-F	H
I. 1. 2183	呋喃 -3- 基	2-CN	5-F	H
I. 1. 2184	呋喃 -3- 基	2-CN	4-CH ₃	H
I. 1. 2185	呋喃 -3- 基	2-CN	5-CH ₃	H
I. 1. 2186	呋喃 -3- 基	2-CN	4-CN	H
I. 1. 2187	呋喃 -3- 基	2-CN	5-CN	H
I. 1. 2188	呋喃 -3- 基	2-CN	4-CF ₃	H
I. 1. 2189	呋喃 -3- 基	2-CN	5-CF ₃	H

I. 1. 2190	呋喃-3-基	2-COOH	4-Cl	5-F
I. 1. 2191	呋喃-3-基	2-COOH	4-Cl	H
I. 1. 2192	呋喃-3-基	2-COOH	5-Cl	H
I. 1. 2193	呋喃-3-基	2-COOH	4-F	H
I. 1. 2194	呋喃-3-基	2-COOH	5-F	H
I. 1. 2195	呋喃-3-基	2-COOH	4-CH ₃	H
I. 1. 2196	呋喃-3-基	2-COOH	5-CH ₃	H

[0207]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2197	呋喃-3-基	2-COOH	4-CN	H
I. 1. 2198	呋喃-3-基	2-COOH	5-CN	H
I. 1. 2199	呋喃-3-基	2-COOH	4-CF ₃	H
I. 1. 2200	呋喃-3-基	2-COOH	5-CF ₃	H
I. 1. 2201	呋喃-3-基	2-COOCH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 2202	呋喃-3-基	2-COOCH ₃	4-Cl	H
I. 1. 2203	呋喃-3-基	2-COOCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2204	呋喃-3-基	2-COOCH ₃	4-F	H
I. 1. 2205	呋喃-3-基	2-COOCH ₃	5-F	H
I. 1. 2206	呋喃-3-基	2-COOCH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 2207	呋喃-3-基	2-COOCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2208	呋喃-3-基	2-COOCH ₃	4-CN	H
I. 1. 2209	呋喃-3-基	2-COOCH ₃	5-CN	H
I. 1. 2210	呋喃-3-基	2-COOCH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 2211	呋喃-3-基	2-COOCH ₃	5-CF ₃	H

I. 1. 2212	呋喃 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 2213	呋喃 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	H
I. 1. 2214	呋喃 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2215	呋喃 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	H
I. 1. 2216	呋喃 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-F	H
I. 1. 2217	呋喃 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 2218	呋喃 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2219	呋喃 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CN	H
I. 1. 2220	呋喃 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CN	H
I. 1. 2221	呋喃 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 2222	呋喃 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2223	呋喃 -3- 基	2- 乙炔基	4-Cl	5-F
I. 1. 2224	呋喃 -3- 基	2- 乙炔基	4-Cl	H
I. 1. 2225	呋喃 -3- 基	2- 乙炔基	5-Cl	H
I. 1. 2226	呋喃 -3- 基	2- 乙炔基	4-F	H
I. 1. 2227	呋喃 -3- 基	2- 乙炔基	5-F	H
I. 1. 2228	呋喃 -3- 基	2- 乙炔基	4-CH ₃	H
I. 1. 2229	呋喃 -3- 基	2- 乙炔基	5-CH ₃	H
I. 1. 2230	呋喃 -3- 基	2- 乙炔基	4-CN	H
I. 1. 2231	呋喃 -3- 基	2- 乙炔基	5-CN	H
I. 1. 2232	呋喃 -3- 基	2- 乙炔基	4-CF ₃	H

[0208]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2233	呋喃 -3- 基	2- 乙炔基	5-CF ₃	H

I. 1. 2234	呋喃 -3- 基	2-I	4-Cl	5-F
I. 1. 2235	呋喃 -3- 基	2-I	4-Cl	H
I. 1. 2236	呋喃 -3- 基	2-I	5-Cl	H
I. 1. 2237	呋喃 -3- 基	2-I	4-F	H
I. 1. 2238	呋喃 -3- 基	2-I	5-F	H
I. 1. 2239	呋喃 -3- 基	2-I	4-CH ₃	H
I. 1. 2240	呋喃 -3- 基	2-I	5-CH ₃	H
I. 1. 2241	呋喃 -3- 基	2-I	4-CN	H
I. 1. 2242	呋喃 -3- 基	2-I	5-CN	H
I. 1. 2243	呋喃 -3- 基	2-I	4-CF ₃	H
I. 1. 2244	呋喃 -3- 基	2-I	5-CF ₃	H
I. 1. 2245	呋喃 -3- 基	2-Cl	4-Cl	5-F
I. 1. 2246	呋喃 -3- 基	2-Cl	4-Cl	H
I. 1. 2247	呋喃 -3- 基	2-Cl	5-Cl	H
I. 1. 2248	呋喃 -3- 基	2-Cl	4-F	H
I. 1. 2249	呋喃 -3- 基	2-Cl	5-F	H
I. 1. 2250	呋喃 -3- 基	2-Cl	4-CH ₃	H
I. 1. 2251	呋喃 -3- 基	2-Cl	5-CH ₃	H
I. 1. 2252	呋喃 -3- 基	2-Cl	4-CN	H
I. 1. 2253	呋喃 -3- 基	2-Cl	5-CN	H
I. 1. 2254	呋喃 -3- 基	2-Cl	4-CF ₃	H
I. 1. 2255	呋喃 -3- 基	2-Cl	5-CF ₃	H
I. 1. 2256	呋喃 -3- 基	2-Br	4-Cl	5-F
I. 1. 2257	呋喃 -3- 基	2-Br	4-Cl	H

I. 1. 2258	呋喃-3-基	2-Br	5-Cl	H
I. 1. 2259	呋喃-3-基	2-Br	4-F	H
I. 1. 2260	呋喃-3-基	2-Br	5-F	H
I. 1. 2261	呋喃-3-基	2-Br	4-CH ₃	H
I. 1. 2262	呋喃-3-基	2-Br	5-CH ₃	H
I. 1. 2263	呋喃-3-基	2-Br	4-CN	H
I. 1. 2264	呋喃-3-基	2-Br	5-CN	H
I. 1. 2265	呋喃-3-基	2-Br	4-CF ₃	H
I. 1. 2266	呋喃-3-基	2-Br	5-CF ₃	H
I. 1. 2267	呋喃-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-Cl	5-F
I. 1. 2268	呋喃-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-Cl	H

[0209]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2269	呋喃-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	H
I. 1. 2270	呋喃-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-F	H
I. 1. 2271	呋喃-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-F	H
I. 1. 2272	呋喃-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-CH ₃	H
I. 1. 2273	呋喃-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 2274	呋喃-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-CN	H
I. 1. 2275	呋喃-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CN	H
I. 1. 2276	呋喃-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-CF ₃	H
I. 1. 2277	呋喃-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 2278	呋喃-3-基	2-CONHCH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 2279	呋喃-3-基	2-CONHCH ₃	4-Cl	H

I. 1. 2280	呋喃 -3- 基	2-CONHCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2281	呋喃 -3- 基	2-CONHCH ₃	4-F	H
I. 1. 2282	呋喃 -3- 基	2-CONHCH ₃	5-F	H
I. 1. 2283	呋喃 -3- 基	2-CONHCH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 2284	呋喃 -3- 基	2-CONHCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2285	呋喃 -3- 基	2-CONHCH ₃	4-CN	H
I. 1. 2286	呋喃 -3- 基	2-CONHCH ₃	5-CN	H
I. 1. 2287	呋喃 -3- 基	2-CONHCH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 2288	呋喃 -3- 基	2-CONHCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2289	呋喃 -3- 基	4-NO ₂	5-Cl	2-F
I. 1. 2290	呋喃 -3- 基	4-NO ₂	5-Cl	H
I. 1. 2291	呋喃 -3- 基	4-NO ₂	2-Cl	H
I. 1. 2292	呋喃 -3- 基	4-NO ₂	5-F	H
I. 1. 2293	呋喃 -3- 基	4-NO ₂	2-F	H
I. 1. 2294	呋喃 -3- 基	4-NO ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 2295	呋喃 -3- 基	4-NO ₂	2-CH ₃	H
I. 1. 2296	呋喃 -3- 基	4-NO ₂	5-CN	H
I. 1. 2297	呋喃 -3- 基	4-NO ₂	2-CN	H
I. 1. 2298	呋喃 -3- 基	4-NO ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 2299	呋喃 -3- 基	4-NO ₂	2-CF ₃	H
I. 1. 2300	呋喃 -3- 基	4-CN	5-Cl	2-F
I. 1. 2301	呋喃 -3- 基	4-CN	5-Cl	H
I. 1. 2302	呋喃 -3- 基	4-CN	2-Cl	H
I. 1. 2303	呋喃 -3- 基	4-CN	5-F	H

I. 1. 2304	呋喃-3-基	4-CN	2-F	H
------------	--------	------	-----	---

[0210]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2305	呋喃-3-基	4-CN	5-CH ₃	H
I. 1. 2306	呋喃-3-基	4-CN	2-CH ₃	H
I. 1. 2307	呋喃-3-基	4-CN	5-CN	H
I. 1. 2308	呋喃-3-基	4-CN	2-CN	H
I. 1. 2309	呋喃-3-基	4-CN	5-CF ₃	H
I. 1. 2310	呋喃-3-基	4-CN	2-CF ₃	H
I. 1. 2311	呋喃-3-基	4-COOH	5-Cl	2-F
I. 1. 2312	呋喃-3-基	4-COOH	5-Cl	H
I. 1. 2313	呋喃-3-基	4-COOH	2-Cl	H
I. 1. 2314	呋喃-3-基	4-COOH	5-F	H
I. 1. 2315	呋喃-3-基	4-COOH	2-F	H
I. 1. 2316	呋喃-3-基	4-COOH	5-CH ₃	H
I. 1. 2317	呋喃-3-基	4-COOH	2-CH ₃	H
I. 1. 2318	呋喃-3-基	4-COOH	5-CN	H
I. 1. 2319	呋喃-3-基	4-COOH	2-CN	H
I. 1. 2320	呋喃-3-基	4-COOH	5-CF ₃	H
I. 1. 2321	呋喃-3-基	4-COOH	2-CF ₃	H
I. 1. 2322	呋喃-3-基	4-COOCH ₃	5-Cl	2-F
I. 1. 2323	呋喃-3-基	4-COOCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2324	呋喃-3-基	4-COOCH ₃	2-Cl	H
I. 1. 2325	呋喃-3-基	4-COOCH ₃	5-F	H

I. 1. 2326	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₃	2-F	H
I. 1. 2327	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2328	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₃	2-CH ₃	H
I. 1. 2329	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₃	5-CN	H
I. 1. 2330	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₃	2-CN	H
I. 1. 2331	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2332	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₃	2-CF ₃	H
I. 1. 2333	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	2-F
I. 1. 2334	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2335	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-Cl	H
I. 1. 2336	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-F	H
I. 1. 2337	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-F	H
I. 1. 2338	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2339	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-CH ₃	H
I. 1. 2340	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-CN	H

[0211]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2341	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-CN	H
I. 1. 2342	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2343	呋喃 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-CF ₃	H
I. 1. 2344	呋喃 -3- 基	4- 乙炔基	5-Cl	2-F
I. 1. 2345	呋喃 -3- 基	4- 乙炔基	5-Cl	H
I. 1. 2346	呋喃 -3- 基	4- 乙炔基	2-Cl	H
I. 1. 2347	呋喃 -3- 基	4- 乙炔基	5-F	H

I. 1. 2348	呋喃 -3- 基	4- 乙炔基	2-F	H
I. 1. 2349	呋喃 -3- 基	4- 乙炔基	5-CH ₃	H
I. 1. 2350	呋喃 -3- 基	4- 乙炔基	2-CH ₃	H
I. 1. 2351	呋喃 -3- 基	4- 乙炔基	5-CN	H
I. 1. 2352	呋喃 -3- 基	4- 乙炔基	2-CN	H
I. 1. 2353	呋喃 -3- 基	4- 乙炔基	5-CF ₃	H
I. 1. 2354	呋喃 -3- 基	4- 乙炔基	2-CF ₃	H
I. 1. 2355	呋喃 -3- 基	4-I	5-Cl	2-F
I. 1. 2356	呋喃 -3- 基	4-I	5-Cl	H
I. 1. 2357	呋喃 -3- 基	4-I	2-Cl	H
I. 1. 2358	呋喃 -3- 基	4-I	5-F	H
I. 1. 2359	呋喃 -3- 基	4-I	2-F	H
I. 1. 2360	呋喃 -3- 基	4-I	5-CH ₃	H
I. 1. 2361	呋喃 -3- 基	4-I	2-CH ₃	H
I. 1. 2362	呋喃 -3- 基	4-I	5-CN	H
I. 1. 2363	呋喃 -3- 基	4-I	2-CN	H
I. 1. 2364	呋喃 -3- 基	4-I	5-CF ₃	H
I. 1. 2365	呋喃 -3- 基	4-I	2-CF ₃	H
I. 1. 2366	呋喃 -3- 基	4-Cl	5-Cl	2-F
I. 1. 2367	呋喃 -3- 基	4-Cl	5-Cl	H
I. 1. 2368	呋喃 -3- 基	4-Cl	2-Cl	H
I. 1. 2369	呋喃 -3- 基	4-Cl	5-F	H
I. 1. 2370	呋喃 -3- 基	4-Cl	2-F	H
I. 1. 2371	呋喃 -3- 基	4-Cl	5-CH ₃	H

I. 1. 2372	呋喃-3-基	4-Cl	2-CH ₃	H
I. 1. 2373	呋喃-3-基	4-Cl	5-CN	H
I. 1. 2374	呋喃-3-基	4-Cl	2-CN	H
I. 1. 2375	呋喃-3-基	4-Cl	5-CF ₃	H
I. 1. 2376	呋喃-3-基	4-Cl	2-CF ₃	H

[0212]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2377	呋喃-3-基	4-Br	5-Cl	2-F
I. 1. 2378	呋喃-3-基	4-Br	5-Cl	H
I. 1. 2379	呋喃-3-基	4-Br	2-Cl	H
I. 1. 2380	呋喃-3-基	4-Br	5-F	H
I. 1. 2381	呋喃-3-基	4-Br	2-F	H
I. 1. 2382	呋喃-3-基	4-Br	5-CH ₃	H
I. 1. 2383	呋喃-3-基	4-Br	2-CH ₃	H
I. 1. 2384	呋喃-3-基	4-Br	5-CN	H
I. 1. 2385	呋喃-3-基	4-Br	2-CN	H
I. 1. 2386	呋喃-3-基	4-Br	5-CF ₃	H
I. 1. 2387	呋喃-3-基	4-Br	2-CF ₃	H
I. 1. 2388	呋喃-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	2-F
I. 1. 2389	呋喃-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	H
I. 1. 2390	呋喃-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	2-Cl	H
I. 1. 2391	呋喃-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	5-F	H
I. 1. 2392	呋喃-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	2-F	H
I. 1. 2393	呋喃-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	5-CH ₃	H

I. 1. 2394	呋喃-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	2-CH ₃	H
I. 1. 2395	呋喃-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	5-CN	H
I. 1. 2396	呋喃-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	2-CN	H
I. 1. 2397	呋喃-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 2398	呋喃-3-基	4-CON(CH ₃) ₂	2-CF ₃	H
I. 1. 2399	呋喃-3-基	4-CONHCH ₃	5-Cl	2-F
I. 1. 2400	呋喃-3-基	4-CONHCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2401	呋喃-3-基	4-CONHCH ₃	2-Cl	H
I. 1. 2402	呋喃-3-基	4-CONHCH ₃	5-F	H
I. 1. 2403	呋喃-3-基	4-CONHCH ₃	2-F	H
I. 1. 2404	呋喃-3-基	4-CONHCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2405	呋喃-3-基	4-CONHCH ₃	2-CH ₃	H
I. 1. 2406	呋喃-3-基	4-CONHCH ₃	5-CN	H
I. 1. 2407	呋喃-3-基	4-CONHCH ₃	2-CN	H
I. 1. 2408	呋喃-3-基	4-CONHCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2409	呋喃-3-基	4-CONHCH ₃	2-CF ₃	H
I. 1. 2410	噻吩-2-基	3-NO ₂	4-Cl	5-F
I. 1. 2411	噻吩-2-基	3-NO ₂	4-Cl	H
I. 1. 2412	噻吩-2-基	3-NO ₂	5-Cl	H

[0213]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2413	噻吩-2-基	3-NO ₂	4-F	H
I. 1. 2414	噻吩-2-基	3-NO ₂	5-F	H
I. 1. 2415	噻吩-2-基	3-NO ₂	4-CH ₃	H

I. 1. 2416	噻吩 -2- 基	3-NO ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 2417	噻吩 -2- 基	3-NO ₂	4-CN	H
I. 1. 2418	噻吩 -2- 基	3-NO ₂	5-CN	H
I. 1. 2419	噻吩 -2- 基	3-NO ₂	4-CF ₃	H
I. 1. 2420	噻吩 -2- 基	3-NO ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 2421	噻吩 -2- 基	3-CN	4-Cl	5-F
I. 1. 2422	噻吩 -2- 基	3-CN	4-Cl	H
I. 1. 2423	噻吩 -2- 基	3-CN	5-Cl	H
I. 1. 2424	噻吩 -2- 基	3-CN	4-F	H
I. 1. 2425	噻吩 -2- 基	3-CN	5-F	H
I. 1. 2426	噻吩 -2- 基	3-CN	4-CH ₃	H
I. 1. 2427	噻吩 -2- 基	3-CN	5-CH ₃	H
I. 1. 2428	噻吩 -2- 基	3-CN	4-CN	H
I. 1. 2429	噻吩 -2- 基	3-CN	5-CN	H
I. 1. 2430	噻吩 -2- 基	3-CN	4-CF ₃	H
I. 1. 2431	噻吩 -2- 基	3-CN	5-CF ₃	H
I. 1. 2432	噻吩 -2- 基	3-COOH	4-Cl	5-F
I. 1. 2433	噻吩 -2- 基	3-COOH	4-Cl	H
I. 1. 2434	噻吩 -2- 基	3-COOH	5-Cl	H
I. 1. 2435	噻吩 -2- 基	3-COOH	4-F	H
I. 1. 2436	噻吩 -2- 基	3-COOH	5-F	H
I. 1. 2437	噻吩 -2- 基	3-COOH	4-CH ₃	H
I. 1. 2438	噻吩 -2- 基	3-COOH	5-CH ₃	H
I. 1. 2439	噻吩 -2- 基	3-COOH	4-CN	H

I. 1. 2440	噻吩 -2- 基	3-COOH	5-CN	H
I. 1. 2441	噻吩 -2- 基	3-COOH	4-CF ₃	H
I. 1. 2442	噻吩 -2- 基	3-COOH	5-CF ₃	H
I. 1. 2443	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 2444	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₃	4-Cl	H
I. 1. 2445	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2446	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₃	4-F	H
I. 1. 2447	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₃	5-F	H
I. 1. 2448	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₃	4-CH ₃	H

[0214]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2449	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2450	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₃	4-CN	H
I. 1. 2451	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₃	5-CN	H
I. 1. 2452	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 2453	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2454	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 2455	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	H
I. 1. 2456	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2457	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-F	H
I. 1. 2458	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-F	H
I. 1. 2459	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 2460	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2461	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-CN	H

I. 1. 2462	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-CN	H
I. 1. 2463	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 2464	噻吩 -2- 基	3-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2465	噻吩 -2- 基	3- 乙炔基	4-Cl	5-F
I. 1. 2466	噻吩 -2- 基	3- 乙炔基	4-Cl	H
I. 1. 2467	噻吩 -2- 基	3- 乙炔基	5-Cl	H
I. 1. 2468	噻吩 -2- 基	3- 乙炔基	4-F	H
I. 1. 2469	噻吩 -2- 基	3- 乙炔基	5-F	H
I. 1. 2470	噻吩 -2- 基	3- 乙炔基	4-CH ₃	H
I. 1. 2471	噻吩 -2- 基	3- 乙炔基	5-CH ₃	H
I. 1. 2472	噻吩 -2- 基	3- 乙炔基	4-CN	H
I. 1. 2473	噻吩 -2- 基	3- 乙炔基	5-CN	H
I. 1. 2474	噻吩 -2- 基	3- 乙炔基	4-CF ₃	H
I. 1. 2475	噻吩 -2- 基	3- 乙炔基	5-CF ₃	H
I. 1. 2476	噻吩 -2- 基	3-I	4-Cl	5-F
I. 1. 2477	噻吩 -2- 基	3-I	4-Cl	H
I. 1. 2478	噻吩 -2- 基	3-I	5-Cl	H
I. 1. 2479	噻吩 -2- 基	3-I	4-F	H
I. 1. 2480	噻吩 -2- 基	3-I	5-F	H
I. 1. 2481	噻吩 -2- 基	3-I	4-CH ₃	H
I. 1. 2482	噻吩 -2- 基	3-I	5-CH ₃	H
I. 1. 2483	噻吩 -2- 基	3-I	4-CN	H
I. 1. 2484	噻吩 -2- 基	3-I	5-CN	H

[0215]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2485	噻吩 -2- 基	3-I	4-CF ₃	H
I. 1. 2486	噻吩 -2- 基	3-I	5-CF ₃	H
I. 1. 2487	噻吩 -2- 基	3-Cl	4-Cl	5-F
I. 1. 2488	噻吩 -2- 基	3-Cl	4-Cl	H
I. 1. 2489	噻吩 -2- 基	3-Cl	5-Cl	H
I. 1. 2490	噻吩 -2- 基	3-Cl	4-F	H
I. 1. 2491	噻吩 -2- 基	3-Cl	5-F	H
I. 1. 2492	噻吩 -2- 基	3-Cl	4-CH ₃	H
I. 1. 2493	噻吩 -2- 基	3-Cl	5-CH ₃	H
I. 1. 2494	噻吩 -2- 基	3-Cl	4-CN	H
I. 1. 2495	噻吩 -2- 基	3-Cl	5-CN	H
I. 1. 2496	噻吩 -2- 基	3-Cl	4-CF ₃	H
I. 1. 2497	噻吩 -2- 基	3-Cl	5-CF ₃	H
I. 1. 2498	噻吩 -2- 基	3-Br	4-Cl	5-F
I. 1. 2499	噻吩 -2- 基	3-Br	4-Cl	H
I. 1. 2500	噻吩 -2- 基	3-Br	5-Cl	H
I. 1. 2501	噻吩 -2- 基	3-Br	4-F	H
I. 1. 2502	噻吩 -2- 基	3-Br	5-F	H
I. 1. 2503	噻吩 -2- 基	3-Br	4-CH ₃	H
I. 1. 2504	噻吩 -2- 基	3-Br	5-CH ₃	H
I. 1. 2505	噻吩 -2- 基	3-Br	4-CN	H
I. 1. 2506	噻吩 -2- 基	3-Br	5-CN	H
I. 1. 2507	噻吩 -2- 基	3-Br	4-CF ₃	H

I. 1. 2508	噻吩 -2- 基	3-Br	5-CF ₃	H
I. 1. 2509	噻吩 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-Cl	5-F
I. 1. 2510	噻吩 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-Cl	H
I. 1. 2511	噻吩 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	H
I. 1. 2512	噻吩 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-F	H
I. 1. 2513	噻吩 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-F	H
I. 1. 2514	噻吩 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-CH ₃	H
I. 1. 2515	噻吩 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 2516	噻吩 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-CN	H
I. 1. 2517	噻吩 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-CN	H
I. 1. 2518	噻吩 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	4-CF ₃	H
I. 1. 2519	噻吩 -2- 基	3-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 2520	噻吩 -2- 基	3-CONHCH ₃	4-Cl	5-F

[0216]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2521	噻吩 -2- 基	3-CONHCH ₃	4-Cl	H
I. 1. 2522	噻吩 -2- 基	3-CONHCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2523	噻吩 -2- 基	3-CONHCH ₃	4-F	H
I. 1. 2524	噻吩 -2- 基	3-CONHCH ₃	5-F	H
I. 1. 2525	噻吩 -2- 基	3-CONHCH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 2526	噻吩 -2- 基	3-CONHCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2527	噻吩 -2- 基	3-CONHCH ₃	4-CN	H
I. 1. 2528	噻吩 -2- 基	3-CONHCH ₃	5-CN	H
I. 1. 2529	噻吩 -2- 基	3-CONHCH ₃	4-CF ₃	H

I. 1. 2530	噻吩 -2- 基	3-CONHCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2531	噻吩 -3- 基	2-NO ₂	4-Cl	5-F
I. 1. 2532	噻吩 -3- 基	2-NO ₂	4-Cl	H
I. 1. 2533	噻吩 -3- 基	2-NO ₂	5-Cl	H
I. 1. 2534	噻吩 -3- 基	2-NO ₂	4-F	H
I. 1. 2535	噻吩 -3- 基	2-NO ₂	5-F	H
I. 1. 2536	噻吩 -3- 基	2-NO ₂	4-CH ₃	H
I. 1. 2537	噻吩 -3- 基	2-NO ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 2538	噻吩 -3- 基	2-NO ₂	4-CN	H
I. 1. 2539	噻吩 -3- 基	2-NO ₂	5-CN	H
I. 1. 2540	噻吩 -3- 基	2-NO ₂	4-CF ₃	H
I. 1. 2541	噻吩 -3- 基	2-NO ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 2542	噻吩 -3- 基	2-CN	4-Cl	5-F
I. 1. 2543	噻吩 -3- 基	2-CN	4-Cl	H
I. 1. 2544	噻吩 -3- 基	2-CN	5-Cl	H
I. 1. 2545	噻吩 -3- 基	2-CN	4-F	H
I. 1. 2546	噻吩 -3- 基	2-CN	5-F	H
I. 1. 2547	噻吩 -3- 基	2-CN	4-CH ₃	H
I. 1. 2548	噻吩 -3- 基	2-CN	5-CH ₃	H
I. 1. 2549	噻吩 -3- 基	2-CN	4-CN	H
I. 1. 2550	噻吩 -3- 基	2-CN	5-CN	H
I. 1. 2551	噻吩 -3- 基	2-CN	4-CF ₃	H
I. 1. 2552	噻吩 -3- 基	2-CN	5-CF ₃	H
I. 1. 2553	噻吩 -3- 基	2-COOH	4-Cl	5-F

I. 1. 2554	噻吩 -3- 基	2-COOH	4-Cl	H
I. 1. 2555	噻吩 -3- 基	2-COOH	5-Cl	H
I. 1. 2556	噻吩 -3- 基	2-COOH	4-F	H

[0217]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2557	噻吩 -3- 基	2-COOH	5-F	H
I. 1. 2558	噻吩 -3- 基	2-COOH	4-CH ₃	H
I. 1. 2559	噻吩 -3- 基	2-COOH	5-CH ₃	H
I. 1. 2560	噻吩 -3- 基	2-COOH	4-CN	H
I. 1. 2561	噻吩 -3- 基	2-COOH	5-CN	H
I. 1. 2562	噻吩 -3- 基	2-COOH	4-CF ₃	H
I. 1. 2563	噻吩 -3- 基	2-COOH	5-CF ₃	H
I. 1. 2564	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 2565	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₃	4-Cl	H
I. 1. 2566	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2567	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₃	4-F	H
I. 1. 2568	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₃	5-F	H
I. 1. 2569	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 2570	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2571	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₃	4-CN	H
I. 1. 2572	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₃	5-CN	H
I. 1. 2573	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 2574	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2575	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	5-F

I. 1. 2576	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-Cl	H
I. 1. 2577	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2578	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-F	H
I. 1. 2579	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-F	H
I. 1. 2580	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 2581	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2582	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CN	H
I. 1. 2583	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CN	H
I. 1. 2584	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 2585	噻吩 -3- 基	2-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2586	噻吩 -3- 基	2- 乙炔基	4-Cl	5-F
I. 1. 2587	噻吩 -3- 基	2- 乙炔基	4-Cl	H
I. 1. 2588	噻吩 -3- 基	2- 乙炔基	5-Cl	H
I. 1. 2589	噻吩 -3- 基	2- 乙炔基	4-F	H
I. 1. 2590	噻吩 -3- 基	2- 乙炔基	5-F	H
I. 1. 2591	噻吩 -3- 基	2- 乙炔基	4-CH ₃	H
I. 1. 2592	噻吩 -3- 基	2- 乙炔基	5-CH ₃	H

[0218]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2593	噻吩 -3- 基	2- 乙炔基	4-CN	H
I. 1. 2594	噻吩 -3- 基	2- 乙炔基	5-CN	H
I. 1. 2595	噻吩 -3- 基	2- 乙炔基	4-CF ₃	H
I. 1. 2596	噻吩 -3- 基	2- 乙炔基	5-CF ₃	H
I. 1. 2597	噻吩 -3- 基	2-I	4-Cl	5-F

I. 1. 2598	噻吩 -3- 基	2-I	4-Cl	H
I. 1. 2599	噻吩 -3- 基	2-I	5-Cl	H
I. 1. 2600	噻吩 -3- 基	2-I	4-F	H
I. 1. 2601	噻吩 -3- 基	2-I	5-F	H
I. 1. 2602	噻吩 -3- 基	2-I	4-CH ₃	H
I. 1. 2603	噻吩 -3- 基	2-I	5-CH ₃	H
I. 1. 2604	噻吩 -3- 基	2-I	4-CN	H
I. 1. 2605	噻吩 -3- 基	2-I	5-CN	H
I. 1. 2606	噻吩 -3- 基	2-I	4-CF ₃	H
I. 1. 2607	噻吩 -3- 基	2-I	5-CF ₃	H
I. 1. 2608	噻吩 -3- 基	2-Cl	4-Cl	5-F
I. 1. 2609	噻吩 -3- 基	2-Cl	4-Cl	H
I. 1. 2610	噻吩 -3- 基	2-Cl	5-Cl	H
I. 1. 2611	噻吩 -3- 基	2-Cl	4-F	H
I. 1. 2612	噻吩 -3- 基	2-Cl	5-F	H
I. 1. 2613	噻吩 -3- 基	2-Cl	4-CH ₃	H
I. 1. 2614	噻吩 -3- 基	2-Cl	5-CH ₃	H
I. 1. 2615	噻吩 -3- 基	2-Cl	4-CN	H
I. 1. 2616	噻吩 -3- 基	2-Cl	5-CN	H
I. 1. 2617	噻吩 -3- 基	2-Cl	4-CF ₃	H
I. 1. 2618	噻吩 -3- 基	2-Cl	5-CF ₃	H
I. 1. 2619	噻吩 -3- 基	2-Br	4-Cl	5-F
I. 1. 2620	噻吩 -3- 基	2-Br	4-Cl	H
I. 1. 2621	噻吩 -3- 基	2-Br	5-Cl	H

I. 1. 2622	噻吩-3-基	2-Br	4-F	H
I. 1. 2623	噻吩-3-基	2-Br	5-F	H
I. 1. 2624	噻吩-3-基	2-Br	4-CH ₃	H
I. 1. 2625	噻吩-3-基	2-Br	5-CH ₃	H
I. 1. 2626	噻吩-3-基	2-Br	4-CN	H
I. 1. 2627	噻吩-3-基	2-Br	5-CN	H
I. 1. 2628	噻吩-3-基	2-Br	4-CF ₃	H

[0219]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2629	噻吩-3-基	2-Br	5-CF ₃	H
I. 1. 2630	噻吩-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-Cl	5-F
I. 1. 2631	噻吩-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-Cl	H
I. 1. 2632	噻吩-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	H
I. 1. 2633	噻吩-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-F	H
I. 1. 2634	噻吩-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-F	H
I. 1. 2635	噻吩-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-CH ₃	H
I. 1. 2636	噻吩-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 2637	噻吩-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-CN	H
I. 1. 2638	噻吩-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CN	H
I. 1. 2639	噻吩-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	4-CF ₃	H
I. 1. 2640	噻吩-3-基	2-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 2641	噻吩-3-基	2-CONHCH ₃	4-Cl	5-F
I. 1. 2642	噻吩-3-基	2-CONHCH ₃	4-Cl	H
I. 1. 2643	噻吩-3-基	2-CONHCH ₃	5-Cl	H

I. 1. 2644	噻吩-3-基	2-CONHCH ₃	4-F	H
I. 1. 2645	噻吩-3-基	2-CONHCH ₃	5-F	H
I. 1. 2646	噻吩-3-基	2-CONHCH ₃	4-CH ₃	H
I. 1. 2647	噻吩-3-基	2-CONHCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2648	噻吩-3-基	2-CONHCH ₃	4-CN	H
I. 1. 2649	噻吩-3-基	2-CONHCH ₃	5-CN	H
I. 1. 2650	噻吩-3-基	2-CONHCH ₃	4-CF ₃	H
I. 1. 2651	噻吩-3-基	2-CONHCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2652	噻吩-3-基	4-NO ₂	5-Cl	2-F
I. 1. 2653	噻吩-3-基	4-NO ₂	5-Cl	H
I. 1. 2654	噻吩-3-基	4-NO ₂	2-Cl	H
I. 1. 2655	噻吩-3-基	4-NO ₂	5-F	H
I. 1. 2656	噻吩-3-基	4-NO ₂	2-F	H
I. 1. 2657	噻吩-3-基	4-NO ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 2658	噻吩-3-基	4-NO ₂	2-CH ₃	H
I. 1. 2659	噻吩-3-基	4-NO ₂	5-CN	H
I. 1. 2660	噻吩-3-基	4-NO ₂	2-CN	H
I. 1. 2661	噻吩-3-基	4-NO ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 2662	噻吩-3-基	4-NO ₂	2-CF ₃	H
I. 1. 2663	噻吩-3-基	4-CN	5-Cl	2-F
I. 1. 2664	噻吩-3-基	4-CN	5-Cl	H

[0220]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2665	噻吩-3-基	4-CN	2-Cl	H

I. 1. 2666	噻吩-3-基	4-CN	5-F	H
I. 1. 2667	噻吩-3-基	4-CN	2-F	H
I. 1. 2668	噻吩-3-基	4-CN	5-CH ₃	H
I. 1. 2669	噻吩-3-基	4-CN	2-CH ₃	H
I. 1. 2670	噻吩-3-基	4-CN	5-CN	H
I. 1. 2671	噻吩-3-基	4-CN	2-CN	H
I. 1. 2672	噻吩-3-基	4-CN	5-CF ₃	H
I. 1. 2673	噻吩-3-基	4-CN	2-CF ₃	H
I. 1. 2674	噻吩-3-基	4-COOH	5-Cl	2-F
I. 1. 2675	噻吩-3-基	4-COOH	5-Cl	H
I. 1. 2676	噻吩-3-基	4-COOH	2-Cl	H
I. 1. 2677	噻吩-3-基	4-COOH	5-F	H
I. 1. 2678	噻吩-3-基	4-COOH	2-F	H
I. 1. 2679	噻吩-3-基	4-COOH	5-CH ₃	H
I. 1. 2680	噻吩-3-基	4-COOH	2-CH ₃	H
I. 1. 2681	噻吩-3-基	4-COOH	5-CN	H
I. 1. 2682	噻吩-3-基	4-COOH	2-CN	H
I. 1. 2683	噻吩-3-基	4-COOH	5-CF ₃	H
I. 1. 2684	噻吩-3-基	4-COOH	2-CF ₃	H
I. 1. 2685	噻吩-3-基	4-COOCH ₃	5-Cl	2-F
I. 1. 2686	噻吩-3-基	4-COOCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2687	噻吩-3-基	4-COOCH ₃	2-Cl	H
I. 1. 2688	噻吩-3-基	4-COOCH ₃	5-F	H
I. 1. 2689	噻吩-3-基	4-COOCH ₃	2-F	H

I. 1. 2690	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2691	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₃	2-CH ₃	H
I. 1. 2692	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₃	5-CN	H
I. 1. 2693	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₃	2-CN	H
I. 1. 2694	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2695	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₃	2-CF ₃	H
I. 1. 2696	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	2-F
I. 1. 2697	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2698	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-Cl	H
I. 1. 2699	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-F	H
I. 1. 2700	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-F	H

[0221]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2701	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2702	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-CH ₃	H
I. 1. 2703	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-CN	H
I. 1. 2704	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-CN	H
I. 1. 2705	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2706	噻吩 -3- 基	4-COOCH ₂ CH ₃	2-CF ₃	H
I. 1. 2707	噻吩 -3- 基	4- 乙炔基	5-Cl	2-F
I. 1. 2708	噻吩 -3- 基	4- 乙炔基	5-Cl	H
I. 1. 2709	噻吩 -3- 基	4- 乙炔基	2-Cl	H
I. 1. 2710	噻吩 -3- 基	4- 乙炔基	5-F	H
I. 1. 2711	噻吩 -3- 基	4- 乙炔基	2-F	H

I. 1. 2712	噻吩 -3- 基	4- 乙炔基	5-CH ₃	H
I. 1. 2713	噻吩 -3- 基	4- 乙炔基	2-CH ₃	H
I. 1. 2714	噻吩 -3- 基	4- 乙炔基	5-CN	H
I. 1. 2715	噻吩 -3- 基	4- 乙炔基	2-CN	H
I. 1. 2716	噻吩 -3- 基	4- 乙炔基	5-CF ₃	H
I. 1. 2717	噻吩 -3- 基	4- 乙炔基	2-CF ₃	H
I. 1. 2718	噻吩 -3- 基	4-I	5-Cl	2-F
I. 1. 2719	噻吩 -3- 基	4-I	5-Cl	H
I. 1. 2720	噻吩 -3- 基	4-I	2-Cl	H
I. 1. 2721	噻吩 -3- 基	4-I	5-F	H
I. 1. 2722	噻吩 -3- 基	4-I	2-F	H
I. 1. 2723	噻吩 -3- 基	4-I	5-CH ₃	H
I. 1. 2724	噻吩 -3- 基	4-I	2-CH ₃	H
I. 1. 2725	噻吩 -3- 基	4-I	5-CN	H
I. 1. 2726	噻吩 -3- 基	4-I	2-CN	H
I. 1. 2727	噻吩 -3- 基	4-I	5-CF ₃	H
I. 1. 2728	噻吩 -3- 基	4-I	2-CF ₃	H
I. 1. 2729	噻吩 -3- 基	4-Cl	5-Cl	2-F
I. 1. 2730	噻吩 -3- 基	4-Cl	5-Cl	H
I. 1. 2731	噻吩 -3- 基	4-Cl	2-Cl	H
I. 1. 2732	噻吩 -3- 基	4-Cl	5-F	H
I. 1. 2733	噻吩 -3- 基	4-Cl	2-F	H
I. 1. 2734	噻吩 -3- 基	4-Cl	5-CH ₃	H
I. 1. 2735	噻吩 -3- 基	4-Cl	2-CH ₃	H

I. 1. 2736	噻吩 -3- 基	4-Cl	5-CN	H
------------	----------	------	------	---

[0222]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2737	噻吩 -3- 基	4-Cl	2-CN	H
I. 1. 2738	噻吩 -3- 基	4-Cl	5-CF ₃	H
I. 1. 2739	噻吩 -3- 基	4-Cl	2-CF ₃	H
I. 1. 2740	噻吩 -3- 基	4-Br	5-Cl	2-F
I. 1. 2741	噻吩 -3- 基	4-Br	5-Cl	H
I. 1. 2742	噻吩 -3- 基	4-Br	2-Cl	H
I. 1. 2743	噻吩 -3- 基	4-Br	5-F	H
I. 1. 2744	噻吩 -3- 基	4-Br	2-F	H
I. 1. 2745	噻吩 -3- 基	4-Br	5-CH ₃	H
I. 1. 2746	噻吩 -3- 基	4-Br	2-CH ₃	H
I. 1. 2747	噻吩 -3- 基	4-Br	5-CN	H
I. 1. 2748	噻吩 -3- 基	4-Br	2-CN	H
I. 1. 2749	噻吩 -3- 基	4-Br	5-CF ₃	H
I. 1. 2750	噻吩 -3- 基	4-Br	2-CF ₃	H
I. 1. 2751	噻吩 -3- 基	4-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	2-F
I. 1. 2752	噻吩 -3- 基	4-CON(CH ₃) ₂	5-Cl	H
I. 1. 2753	噻吩 -3- 基	4-CON(CH ₃) ₂	2-Cl	H
I. 1. 2754	噻吩 -3- 基	4-CON(CH ₃) ₂	5-F	H
I. 1. 2755	噻吩 -3- 基	4-CON(CH ₃) ₂	2-F	H
I. 1. 2756	噻吩 -3- 基	4-CON(CH ₃) ₂	5-CH ₃	H
I. 1. 2757	噻吩 -3- 基	4-CON(CH ₃) ₂	2-CH ₃	H

I. 1. 2758	噻吩 -3- 基	4-CON(CH ₃) ₂	5-CN	H
I. 1. 2759	噻吩 -3- 基	4-CON(CH ₃) ₂	2-CN	H
I. 1. 2760	噻吩 -3- 基	4-CON(CH ₃) ₂	5-CF ₃	H
I. 1. 2761	噻吩 -3- 基	4-CON(CH ₃) ₂	2-CF ₃	H
I. 1. 2762	噻吩 -3- 基	4-CONHCH ₃	5-Cl	2-F
I. 1. 2763	噻吩 -3- 基	4-CONHCH ₃	5-Cl	H
I. 1. 2764	噻吩 -3- 基	4-CONHCH ₃	2-Cl	H
I. 1. 2765	噻吩 -3- 基	4-CONHCH ₃	5-F	H
I. 1. 2766	噻吩 -3- 基	4-CONHCH ₃	2-F	H
I. 1. 2767	噻吩 -3- 基	4-CONHCH ₃	5-CH ₃	H
I. 1. 2768	噻吩 -3- 基	4-CONHCH ₃	2-CH ₃	H
I. 1. 2769	噻吩 -3- 基	4-CONHCH ₃	5-CN	H
I. 1. 2770	噻吩 -3- 基	4-CONHCH ₃	2-CN	H
I. 1. 2771	噻吩 -3- 基	4-CONHCH ₃	5-CF ₃	H
I. 1. 2772	噻吩 -3- 基	4-CONHCH ₃	2-CF ₃	H

[0223]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2773	苯基	3- 甲基异噻唑 -5- 基	H	H
I. 1. 2774	苯基	3- 甲基异噻唑 -5- 基	3-Cl	H
I. 1. 2775	苯基	3- 甲基异噻唑 -5- 基	4-Cl	H
I. 1. 2776	苯基	3- 甲基异噻唑 -5- 基	5-Cl	H
I. 1. 2777	苯基	3- 甲基异噻唑 -5- 基	6-Cl	H
I. 1. 2778	苯基	3- 甲基异噻唑 -5- 基	3-F	H
I. 1. 2779	苯基	3- 甲基异噻唑 -5- 基	4-F	H

I. 1. 2780	苯基	3- 甲基异噻唑 -5- 基	5-F	H
I. 1. 2781	苯基	3- 甲基异噻唑 -5- 基	6-F	H
I. 1. 2782	苯基	3- 甲基异噻唑 -5- 基	3-CH ₃	H
I. 1. 2783	苯基	3- 甲基异噻唑 -5- 基	4-CH ₃	H
I. 1. 2784	苯基	3- 甲基异噻唑 -5- 基	5-CH ₃	H
I. 1. 2785	苯基	3- 甲基异噻唑 -5- 基	6-CH ₃	H
I. 1. 2786	苯基	3- 甲基异噻唑 -5- 基	5- 乙烯基	H
I. 1. 2787	苯基	3- 甲基异噻唑 -5- 基	6- 乙烯基	H
I. 1. 2788	苯基	2- 呋喃基	H	H
I. 1. 2789	苯基	2- 呋喃基	3-Cl	H
I. 1. 2790	苯基	2- 呋喃基	4-Cl	H
I. 1. 2791	苯基	2- 呋喃基	5-Cl	H
I. 1. 2792	苯基	2- 呋喃基	6-Cl	H
I. 1. 2793	苯基	2- 呋喃基	3-F	H
I. 1. 2794	苯基	2- 呋喃基	4-F	H
I. 1. 2795	苯基	2- 呋喃基	5-F	H
I. 1. 2796	苯基	2- 呋喃基	6-F	H
I. 1. 2797	苯基	2- 呋喃基	3-CH ₃	H
I. 1. 2798	苯基	2- 呋喃基	4-CH ₃	H
I. 1. 2799	苯基	2- 呋喃基	5-CH ₃	H
I. 1. 2800	苯基	2- 呋喃基	6-CH ₃	H
I. 1. 2801	苯基	2- 呋喃基	5- 乙烯基	H
I. 1. 2802	苯基	2- 呋喃基	6- 乙烯基	H
I. 1. 2803	苯基	2- 噻吩基	H	H

I. 1. 2804	苯基	2- 噻吩基	3-Cl	H
I. 1. 2805	苯基	2- 噻吩基	4-Cl	H
I. 1. 2806	苯基	2- 噻吩基	5-Cl	H
I. 1. 2807	苯基	2- 噻吩基	6-Cl	H
I. 1. 2808	苯基	2- 噻吩基	3-F	H

[0224]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2809	苯基	2- 噻吩基	4-F	H
I. 1. 2810	苯基	2- 噻吩基	5-F	H
I. 1. 2811	苯基	2- 噻吩基	6-F	H
I. 1. 2812	苯基	2- 噻吩基	3-CH ₃	H
I. 1. 2813	苯基	2- 噻吩基	4-CH ₃	H
I. 1. 2814	苯基	2- 噻吩基	5-CH ₃	H
I. 1. 2815	苯基	2- 噻吩基	6-CH ₃	H
I. 1. 2816	苯基	2- 噻吩基	5- 乙烯基	H
I. 1. 2817	苯基	2- 噻吩基	6- 乙烯基	H
I. 1. 2818	苯基	2- 噁唑基	H	H
I. 1. 2819	苯基	2- 噁唑基	3-Cl	H
I. 1. 2820	苯基	2- 噁唑基	4-Cl	H
I. 1. 2821	苯基	2- 噁唑基	5-Cl	H
I. 1. 2822	苯基	2- 噁唑基	6-Cl	H
I. 1. 2823	苯基	2- 噁唑基	3-F	H
I. 1. 2824	苯基	2- 噁唑基	4-F	H
I. 1. 2825	苯基	2- 噁唑基	5-F	H

I. 1. 2826	苯基	2- 噁唑基	6-F	H
I. 1. 2827	苯基	2- 噁唑基	3-CH ₃	H
I. 1. 2828	苯基	2- 噁唑基	4-CH ₃	H
I. 1. 2829	苯基	2- 噁唑基	5-CH ₃	H
I. 1. 2830	苯基	2- 噁唑基	6-CH ₃	H
I. 1. 2831	苯基	2- 噁唑基	5- 乙烯基	H
I. 1. 2832	苯基	2- 噁唑基	6- 乙烯基	H
I. 1. 2833	苯基	4- 甲基噁唑 -2- 基	H	H
I. 1. 2834	苯基	4- 甲基噁唑 -2- 基	3-Cl	H
I. 1. 2835	苯基	4- 甲基噁唑 -2- 基	4-Cl	H
I. 1. 2836	苯基	4- 甲基噁唑 -2- 基	5-Cl	H
I. 1. 2837	苯基	4- 甲基噁唑 -2- 基	6-Cl	H
I. 1. 2838	苯基	4- 甲基噁唑 -2- 基	3-F	H
I. 1. 2839	苯基	4- 甲基噁唑 -2- 基	4-F	H
I. 1. 2840	苯基	4- 甲基噁唑 -2- 基	5-F	H
I. 1. 2841	苯基	4- 甲基噁唑 -2- 基	6-F	H
I. 1. 2842	苯基	4- 甲基噁唑 -2- 基	3-CH ₃	H
I. 1. 2843	苯基	4- 甲基噁唑 -2- 基	4-CH ₃	H
I. 1. 2844	苯基	4- 甲基噁唑 -2- 基	5-CH ₃	H

[0225]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2845	苯基	4- 甲基噁唑 -2- 基	6-CH ₃	H
I. 1. 2846	苯基	4- 甲基噁唑 -2- 基	5- 乙烯基	H
I. 1. 2847	苯基	4- 甲基噁唑 -2- 基	6- 乙烯基	H

I. 1. 2848	苯基	2- 噻唑基	H	H
I. 1. 2849	苯基	2- 噻唑基	3-Cl	H
I. 1. 2850	苯基	2- 噻唑基	4-Cl	H
I. 1. 2851	苯基	2- 噻唑基	5-Cl	H
I. 1. 2852	苯基	2- 噻唑基	6-Cl	H
I. 1. 2853	苯基	2- 噻唑基	3-F	H
I. 1. 2854	苯基	2- 噻唑基	4-F	H
I. 1. 2855	苯基	2- 噻唑基	5-F	H
I. 1. 2856	苯基	2- 噻唑基	6-F	H
I. 1. 2857	苯基	2- 噻唑基	3-CH ₃	H
I. 1. 2858	苯基	2- 噻唑基	4-CH ₃	H
I. 1. 2859	苯基	2- 噻唑基	5-CH ₃	H
I. 1. 2860	苯基	2- 噻唑基	6-CH ₃	H
I. 1. 2861	苯基	2- 噻唑基	5- 乙烯基	H
I. 1. 2862	苯基	2- 噻唑基	6- 乙烯基	H
I. 1. 2863	苯基	2- 吡啶基	H	H
I. 1. 2864	苯基	2- 吡啶基	3-Cl	H
I. 1. 2865	苯基	2- 吡啶基	4-Cl	H
I. 1. 2866	苯基	2- 吡啶基	5-Cl	H
I. 1. 2867	苯基	2- 吡啶基	6-Cl	H
I. 1. 2868	苯基	2- 吡啶基	3-F	H
I. 1. 2869	苯基	2- 吡啶基	4-F	H
I. 1. 2870	苯基	2- 吡啶基	5-F	H
I. 1. 2871	苯基	2- 吡啶基	6-F	H

I. 1. 2872	苯基	2- 吡啶基	3-CH ₃	H
I. 1. 2873	苯基	2- 吡啶基	4-CH ₃	H
I. 1. 2874	苯基	2- 吡啶基	5-CH ₃	H
I. 1. 2875	苯基	2- 吡啶基	6-CH ₃	H
I. 1. 2876	苯基	2- 吡啶基	5- 乙烯基	H
I. 1. 2877	苯基	2- 吡啶基	6- 乙烯基	H
I. 1. 2878	苯基	3- 吡啶基	H	H
I. 1. 2879	苯基	3- 吡啶基	3-Cl	H
I. 1. 2880	苯基	3- 吡啶基	4-Cl	H

[0226]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2881	苯基	3- 吡啶基	5-Cl	H
I. 1. 2882	苯基	3- 吡啶基	6-Cl	H
I. 1. 2883	苯基	3- 吡啶基	3-F	H
I. 1. 2884	苯基	3- 吡啶基	4-F	H
I. 1. 2885	苯基	3- 吡啶基	5-F	H
I. 1. 2886	苯基	3- 吡啶基	6-F	H
I. 1. 2887	苯基	3- 吡啶基	3-CH ₃	H
I. 1. 2888	苯基	3- 吡啶基	4-CH ₃	H
I. 1. 2889	苯基	3- 吡啶基	5-CH ₃	H
I. 1. 2890	苯基	3- 吡啶基	6-CH ₃	H
I. 1. 2891	苯基	3- 吡啶基	5- 乙烯基	H
I. 1. 2892	苯基	3- 吡啶基	6- 乙烯基	H
I. 1. 2893	苯基	2- 嘧啶基	H	H

I. 1. 2894	苯基	2- 嘧啶基	3-Cl	H
I. 1. 2895	苯基	2- 嘧啶基	4-Cl	H
I. 1. 2896	苯基	2- 嘧啶基	5-Cl	H
I. 1. 2897	苯基	2- 嘧啶基	6-Cl	H
I. 1. 2898	苯基	2- 嘧啶基	3-F	H
I. 1. 2899	苯基	2- 嘧啶基	4-F	H
I. 1. 2900	苯基	2- 嘧啶基	5-F	H
I. 1. 2901	苯基	2- 嘧啶基	6-F	H
I. 1. 2902	苯基	2- 嘧啶基	3-CH ₃	H
I. 1. 2903	苯基	2- 嘧啶基	4-CH ₃	H
I. 1. 2904	苯基	2- 嘧啶基	5-CH ₃	H
I. 1. 2905	苯基	2- 嘧啶基	6-CH ₃	H
I. 1. 2906	苯基	2- 嘧啶基	5- 乙烯基	H
I. 1. 2907	苯基	2- 嘧啶基	6- 乙烯基	H
I. 1. 2908	苯基	2- 吡嗪基	H	H
I. 1. 2909	苯基	2- 吡嗪基	3-Cl	H
I. 1. 2910	苯基	2- 吡嗪基	4-Cl	H
I. 1. 2911	苯基	2- 吡嗪基	5-Cl	H
I. 1. 2912	苯基	2- 吡嗪基	6-Cl	H
I. 1. 2913	苯基	2- 吡嗪基	3-F	H
I. 1. 2914	苯基	2- 吡嗪基	4-F	H
I. 1. 2915	苯基	2- 吡嗪基	5-F	H
I. 1. 2916	苯基	2- 吡嗪基	6-F	H

[0227]

化合物序号	A ¹	R ^a	R ^b 或 H	R ^c 或 H
I. 1. 2917	苯基	2- 吡嗪基	3-CH ₃	H
I. 1. 2918	苯基	2- 吡嗪基	4-CH ₃	H
I. 1. 2919	苯基	2- 吡嗪基	5-CH ₃	H
I. 1. 2920	苯基	2- 吡嗪基	6-CH ₃	H
I. 1. 2921	苯基	2- 吡嗪基	5- 乙烯基	H
I. 1. 2922	苯基	2- 吡嗪基	6- 乙烯基	H

[0228] 同样优选式 I. 2 化合物, 特别优选化合物 I. 2. 1-I. 2. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 2. 1-I. 2. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 A²R^dR^eR^f 为 2- 氯苯基。

[0229] 同样优选式 I. 3 化合物, 特别优选化合物 I. 3. 1-I. 3. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 3. 1-I. 3. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 A²R^dR^eR^f 为 3- 氯苯基。

[0230] 同样优选式 I. 4 化合物, 特别优选化合物 I. 4. 1-I. 4. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 4. 1-I. 4. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 A²R^dR^eR^f 为 4- 氯苯基。

[0231] 同样优选式 I. 5 化合物, 特别优选化合物 I. 5. 1-I. 5. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 5. 1-I. 5. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 A²R^dR^eR^f 为 2- 三氟甲基苯基。

[0232] 同样优选式 I. 6 化合物, 特别优选化合物 I. 6. 1-I. 6. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 6. 1-I. 6. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 A²R^dR^eR^f 为 3- 三氟甲基苯基。

[0233] 同样优选式 I. 7 化合物, 特别优选化合物 I. 7. 1-I. 7. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 7. 1-I. 7. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 A²R^dR^eR^f 为 4- 三氟甲基苯基。

[0234] 同样优选式 I. 8 化合物, 特别优选化合物 I. 8. 1-I. 8. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 8. 1-I. 8. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 A²R^dR^eR^f 为 2- 甲氧基苯基。

[0235] 同样优选式 I. 9 化合物, 特别优选化合物 I. 9. 1-I. 9. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 9. 1-I. 9. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 A²R^dR^eR^f 为 3- 甲氧基苯基。

[0236] 同样优选式 I. 10 化合物, 特别优选化合物 I. 10. 1-I. 10. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 10. 1-I. 10. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 A²R^dR^eR^f 为 4- 甲氧基苯基。

[0237] 同样优选式 I. 11 化合物, 特别优选化合物 I. 11. 1-I. 11. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 11. 1-I. 11. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氟苯基。

[0238] 同样优选式 I. 12 化合物, 特别优选化合物 I. 12. 1-I. 12. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 12. 1-I. 12. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氟苯基。

[0239] 同样优选式 I. 13 化合物, 特别优选化合物 I. 13. 1-I. 13. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 13. 1-I. 13. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于 A^2 为 4- 氟苯基。

[0240] 同样优选式 I. 14 化合物, 特别优选化合物 I. 14. 1-I. 14. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 14. 1-I. 14. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 甲基苯基。

[0241] 同样优选式 I. 15 化合物, 特别优选化合物 I. 15. 1-I. 15. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 15. 1-I. 15. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 甲基苯基。

[0242] 同样优选式 I. 16 化合物, 特别优选化合物 I. 16. 1-I. 16. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 16. 1-I. 16. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 甲基苯基。

[0243] 同样优选式 I. 17 化合物, 特别优选化合物 I. 17. 1-I. 17. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 17. 1-I. 17. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯 -3- 甲基苯基。

[0244] 同样优选式 I. 18 化合物, 特别优选化合物 I. 18. 1-I. 18. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 18. 1-I. 18. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯 -4- 甲基苯基。

[0245] 同样优选式 I. 19 化合物, 特别优选化合物 I. 19. 1-I. 19. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 19. 1-I. 19. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯 -5- 甲基苯基。

[0246] 同样优选式 I. 20 化合物, 特别优选化合物 I. 20. 1-I. 20. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 20. 1-I. 20. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯 -6- 甲基苯基。

[0247] 同样优选式 I. 21 化合物, 特别优选化合物 I. 21. 1-I. 21. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 21. 1-I. 21. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2, 3- 二氯苯基。

[0248] 同样优选式 I. 22 化合物, 特别优选化合物 I. 22. 1-I. 22. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 22. 1-I. 22. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2, 4- 二氯苯基。

[0249] 同样优选式 I. 23 化合物, 特别优选化合物 I. 23. 1-I. 23. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 23. 1-I. 23. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2, 5- 二氯苯基。

[0250] 同样优选式 I. 24 化合物, 特别优选化合物 I. 24. 1-I. 24. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 24. 1-I. 24. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2,6- 二氯苯基。

[0251] 同样优选式 I. 25 化合物, 特别优选化合物 I. 25. 1-I. 25. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 25. 1-I. 25. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯 -3- 氟苯基。

[0252] 同样优选式 I. 26 化合物, 特别优选化合物 I. 26. 1-I. 26. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 26. 1-I. 26. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯 -4- 氟苯基。

[0253] 同样优选式 I. 27 化合物, 特别优选化合物 I. 27. 1-I. 27. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 27. 1-I. 27. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯 -5- 氟苯基。

[0254] 同样优选式 I. 28 化合物, 特别优选化合物 I. 28. 1-I. 28. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 28. 1-I. 28. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯 -6- 氟苯基。

[0255] 同样优选式 I. 29 化合物, 特别优选化合物 I. 29. 1-I. 29. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 29. 1-I. 29. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2,3- 二氟苯基。

[0256] 同样优选式 I. 30 化合物, 特别优选化合物 I. 30. 1-I. 30. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 30. 1-I. 30. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2,4- 二氟苯基。

[0257] 同样优选式 I. 31 化合物, 特别优选化合物 I. 31. 1-I. 31. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 31. 1-I. 31. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2,5- 二氟苯基。

[0258] 同样优选式 I. 32 化合物, 特别优选化合物 I. 32. 1-I. 32. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 32. 1-I. 32. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2,6- 二氟苯基。

[0259] 同样优选式 I. 33 化合物, 特别优选化合物 I. 33. 1-I. 33. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 33. 1-I. 33. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氟 -3- 氯苯基。

[0260] 同样优选式 I. 34 化合物, 特别优选化合物 I. 34. 1-I. 34. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 34. 1-I. 34. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氟 -4- 氯苯基。

[0261] 同样优选式 I. 35 化合物, 特别优选化合物 I. 35. 1-I. 35. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 35. 1-I. 35. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氟 -5- 氯苯基。

[0262] 同样优选式 I. 36 化合物, 特别优选化合物 I. 36. 1-I. 36. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 36. 1-I. 36. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3,4- 二氟苯基。

[0263] 同样优选式 I. 37 化合物, 特别优选化合物 I. 37. 1-I. 37. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 37. 1-I. 37. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3,5- 二氟苯基。

[0264] 同样优选式 I. 38 化合物, 特别优选化合物 I. 38. 1-I. 38. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 38. 1-I. 38. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3,4- 二氯苯基。

[0265] 同样优选式 I. 39 化合物, 特别优选化合物 I. 39. 1-I. 39. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 39. 1-I. 39. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3,5- 二氯苯基。

[0266] 同样优选式 I. 40 化合物, 特别优选化合物 I. 40. 1-I. 40. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 40. 1-I. 40. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氟 -4- 氯苯基。

[0267] 同样优选式 I. 41 化合物, 特别优选化合物 I. 41. 1-I. 41. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 41. 1-I. 41. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氟 -3- 氯苯基。

[0268] 同样优选式 I. 42 化合物, 特别优选化合物 I. 42. 1-I. 42. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 42. 1-I. 42. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氟 -5- 氯苯基。

[0269] 同样优选式 I. 43 化合物, 特别优选化合物 I. 43. 1-I. 43. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 43. 1-I. 43. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为吡啶 -2- 基。

[0270] 同样优选式 I. 44 化合物, 特别优选化合物 I. 44. 1-I. 44. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 44. 1-I. 44. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氯吡啶 -2- 基。

[0271] 同样优选式 I. 45 化合物, 特别优选化合物 I. 45. 1-I. 45. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 45. 1-I. 45. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氯吡啶 -2- 基。

[0272] 同样优选式 I. 46 化合物, 特别优选化合物 I. 46. 1-I. 46. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 46. 1-I. 46. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 氯吡啶 -2- 基。

[0273] 同样优选式 I. 47 化合物, 特别优选化合物 I. 47. 1-I. 47. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 47. 1-I. 47. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6- 氯吡啶 -2- 基。

[0274] 同样优选式 I. 48 化合物, 特别优选化合物 I. 48. 1-I. 48. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 48. 1-I. 48. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 三氟甲基吡啶 -2- 基。

[0275] 同样优选式 I. 49 化合物, 特别优选化合物 I. 49. 1-I. 49. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 49. 1-I. 49. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 三氟甲基吡啶 -2- 基。

[0276] 同样优选式 I. 50 化合物, 特别优选化合物 I. 50. 1-I. 50. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 50. 1-I. 50. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 三氟甲基吡啶 -2- 基。

[0277] 同样优选式 I. 51 化合物, 特别优选化合物 I. 51. 1-I. 51. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 51. 1-I. 51. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6- 三氟甲基吡啶 -2- 基。

[0278] 同样优选式 I. 52 化合物, 特别优选化合物 I. 52. 1-I. 52. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 52. 1-I. 52. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 甲氧基吡啶 -2- 基。

[0279] 同样优选式 I. 53 化合物, 特别优选化合物 I. 53. 1-I. 53. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 53. 1-I. 53. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 甲氧基吡啶 -2- 基。

[0280] 同样优选式 I. 54 化合物, 特别优选化合物 I. 54. 1-I. 54. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 54. 1-I. 54. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 甲氧基吡啶 -2- 基。

[0281] 同样优选式 I. 55 化合物, 特别优选化合物 I. 55. 1-I. 55. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 55. 1-I. 55. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6- 甲氧基吡啶 -2- 基。

[0282] 同样优选式 I. 56 化合物, 特别优选化合物 I. 56. 1-I. 56. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 56. 1-I. 56. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氟吡啶 -2- 基。

[0283] 同样优选式 I. 57 化合物, 特别优选化合物 I. 57. 1-I. 57. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 57. 1-I. 57. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氟吡啶 -2- 基。

[0284] 同样优选式 I. 58 化合物, 特别优选化合物 I. 58. 1-I. 58. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 58. 1-I. 58. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 氟吡啶 -2- 基。

[0285] 同样优选式 I. 59 化合物, 特别优选化合物 I. 59. 1-I. 59. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 59. 1-I. 59. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6- 氟吡啶 -2- 基。

[0286] 同样优选式 I. 60 化合物, 特别优选化合物 I. 60. 1-I. 60. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 60. 1-I. 60. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为吡啶 -3- 基。

[0287] 同样优选式 I. 61 化合物, 特别优选化合物 I. 61. 1-I. 61. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 61. 1-I. 61. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯吡啶 -3- 基。

[0288] 同样优选式 I. 62 化合物, 特别优选化合物 I. 62. 1-I. 62. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 62. 1-I. 62. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氯吡啶 -3- 基。

[0289] 同样优选式 I. 63 化合物, 特别优选化合物 I. 63. 1-I. 63. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 63. 1-I. 63. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 氯吡啶 -3- 基。

[0290] 同样优选式 I. 64 化合物, 特别优选化合物 I. 64. 1-I. 64. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 64. 1-I. 64. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6- 氯吡啶 -3- 基。

[0291] 同样优选式 I. 65 化合物, 特别优选化合物 I. 65. 1-I. 65. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 65. 1-I. 65. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 三氟甲基吡啶 -3- 基。

[0292] 同样优选式 I. 66 化合物, 特别优选化合物 I. 66. 1-I. 66. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 66. 1-I. 66. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 三氟甲基吡啶 -3- 基。

[0293] 同样优选式 I. 67 化合物, 特别优选化合物 I. 67. 1-I. 67. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 67. 1-I. 67. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 三氟甲基吡啶 -3- 基。

[0294] 同样优选式 I. 68 化合物, 特别优选化合物 I. 68. 1-I. 68. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 68. 1-I. 68. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6- 三氟甲基吡啶 -3- 基。

[0295] 同样优选式 I. 69 化合物, 特别优选化合物 I. 69. 1-I. 69. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 69. 1-I. 69. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 甲氧基吡啶 -3- 基。

[0296] 同样优选式 I. 70 化合物, 特别优选化合物 I. 70. 1-I. 70. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 70. 1-I. 70. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 甲氧基吡啶 -3- 基。

[0297] 同样优选式 I. 71 化合物, 特别优选化合物 I. 71. 1-I. 71. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 71. 1-I. 71. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 甲氧基吡啶 -3- 基。

[0298] 同样优选式 I. 72 化合物, 特别优选化合物 I. 72. 1-I. 72. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 72. 1-I. 72. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6- 甲氧基吡啶 -3- 基。

[0299] 同样优选式 I. 73 化合物, 特别优选化合物 I. 73. 1-I. 73. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 73. 1-I. 73. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氟吡啶 -3- 基。

[0300] 同样优选式 I. 74 化合物, 特别优选化合物 I. 74. 1-I. 74. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 74. 1-I. 74. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氟吡啶 -3- 基。

[0301] 同样优选式 I. 75 化合物, 特别优选化合物 I. 75. 1-I. 75. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 75. 1-I. 75. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 氟吡啶 -3- 基。

[0302] 同样优选式 I. 76 化合物, 特别优选化合物 I. 76. 1-I. 76. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 76. 1-I. 76. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6- 氟吡啶 -3- 基。

[0303] 同样优选式 I. 77 化合物, 特别优选化合物 I. 77. 1-I. 77. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 77. 1-I. 77. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为吡啶 -4- 基。

[0304] 同样优选式 I. 78 化合物, 特别优选化合物 I. 78. 1-I. 78. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 78. 1-I. 78. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氟吡啶 -4- 基。

[0305] 同样优选式 I. 79 化合物, 特别优选化合物 I. 79. 1-I. 79. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 79. 1-I. 79. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氟吡啶 -4- 基。

[0306] 同样优选式 I. 80 化合物, 特别优选化合物 I. 80. 1-I. 80. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 80. 1-I. 80. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 甲氧基吡啶 -4- 基。

[0307] 同样优选式 I. 81 化合物, 特别优选化合物 I. 81. 1-I. 81. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 81. 1-I. 81. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 甲氧基吡啶 -4- 基。

[0308] 同样优选式 I. 82 化合物, 特别优选化合物 I. 82. 1-I. 82. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 82. 1-I. 82. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 三氟甲基吡啶 -4- 基。

[0309] 同样优选式 I. 83 化合物, 特别优选化合物 I. 83. 1-I. 83. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 83. 1-I. 83. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 三氟甲基吡啶 -4- 基。

[0310] 同样优选式 I. 84 化合物, 特别优选化合物 I. 84. 1-I. 84. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 84. 1-I. 84. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯吡啶 -4- 基。

[0311] 同样优选式 I. 85 化合物, 特别优选化合物 I. 85. 1-I. 85. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 85. 1-I. 85. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氯吡啶 -4- 基。

[0312] 同样优选式 I. 86 化合物, 特别优选化合物 I. 86. 1-I. 86. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 86. 1-I. 86. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为噻吩 -2- 基。

[0313] 同样优选式 I. 87 化合物, 特别优选化合物 I. 87. 1-I. 87. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 87. 1-I. 87. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氯噻吩 -2- 基。

[0314] 同样优选式 I. 88 化合物, 特别优选化合物 I. 88. 1-I. 88. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 88. 1-I. 88. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氯噻吩 -2- 基。

[0315] 同样优选式 I. 89 化合物, 特别优选化合物 I. 89. 1-I. 89. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 89. 1-I. 89. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 氯噻吩 -2- 基。

[0316] 同样优选式 I. 90 化合物, 特别优选化合物 I. 90. 1-I. 90. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 90. 1-I. 90. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 三氟甲基噻吩 -2- 基。

[0317] 同样优选式 I. 91 化合物, 特别优选化合物 I. 91. 1-I. 91. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 91. 1-I. 91. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 三氟甲基噻吩 -2- 基。

[0318] 同样优选式 I. 92 化合物, 特别优选化合物 I. 92. 1-I. 92. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 92. 1-I. 92. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 三氟甲基噻吩 -2- 基。

[0319] 同样优选式 I. 93 化合物, 特别优选化合物 I. 93. 1-I. 93. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 93. 1-I. 93. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 甲氧基噻吩 2- 基。

[0320] 同样优选式 I. 94 化合物, 特别优选化合物 I. 94. 1-I. 94. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 94. 1-I. 94. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 甲氧基噻吩 -2- 基。

[0321] 同样优选式 I. 95 化合物, 特别优选化合物 I. 95. 1-I. 95. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 95. 1-I. 95. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 甲氧基噻吩 -2- 基。

[0322] 同样优选式 I. 96 化合物, 特别优选化合物 I. 96. 1-I. 96. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 96. 1-I. 96. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氟噻吩 -2- 基。

[0323] 同样优选式 I. 97 化合物, 特别优选化合物 I. 97. 1-I. 97. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 97. 1-I. 97. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氟噻吩 -2- 基。

[0324] 同样优选式 I. 98 化合物, 特别优选化合物 I. 98. 1-I. 98. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 98. 1-I. 98. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5 氟噻吩 -2- 基。

[0325] 同样优选式 I. 99 化合物, 特别优选化合物 I. 99. 1-I. 99. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 99. 1-I. 99. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为噻吩 -3- 基。

[0326] 同样优选式 I. 100 化合物, 特别优选化合物 I. 100. 1-I. 100. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 100. 1-I. 100. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯噻吩 -3- 基。

[0327] 同样优选式 I. 101 化合物, 特别优选化合物 I. 101. 1-I. 101. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 101. 1-I. 101. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氯噻吩 -3- 基。

[0328] 同样优选式 I.102 化合物, 特别优选化合物 I.102.1-I.102.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.102.1-I.102.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5-氯噻吩-3-基。

[0329] 同样优选式 I.103 化合物, 特别优选化合物 I.103.1-I.103.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.103.1-I.103.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-氟噻吩-3-基。

[0330] 同样优选式 I.104 化合物, 特别优选化合物 I.104.1-I.104.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.104.1-I.104.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-氟噻吩-3-基。

[0331] 同样优选式 I.105 化合物, 特别优选化合物 I.105.1-I.105.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.105.1-I.105.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5-氟噻吩-3-基。

[0332] 同样优选式 I.106 化合物, 特别优选化合物 I.106.1-I.106.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.106.1-I.106.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-甲氧基噻吩-3-基。

[0333] 同样优选式 I.107 化合物, 特别优选化合物 I.107.1-I.107.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.107.1-I.107.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-甲氧基噻吩-3-基。

[0334] 同样优选式 I.108 化合物, 特别优选化合物 I.108.1-I.108.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.108.1-I.108.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5-甲氧基噻吩-3-基。

[0335] 同样优选式 I.109 化合物, 特别优选化合物 I.109.1-I.109.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.109.1-I.109.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-三氟甲基噻吩-3-基。

[0336] 同样优选式 I.110 化合物, 特别优选化合物 I.110.1-I.110.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.110.1-I.110.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-三氟甲基噻吩-3-基。

[0337] 同样优选式 I.111 化合物, 特别优选化合物 I.111.1-I.111.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.111.1-I.111.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5-三氟甲基噻吩-3-基。

[0338] 同样优选式 I.112 化合物, 特别优选化合物 I.112.1-I.112.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.112.1-I.112.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 呋喃-2-基。

[0339] 同样优选式 I.113 化合物, 特别优选化合物 I.113.1-I.113.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.113.1-I.113.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3-氯呋喃-2-基。

[0340] 同样优选式 I.114 化合物, 特别优选化合物 I.114.1-I.114.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.114.1-I.114.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-氯呋喃-2-基。

[0341] 同样优选式 I.115 化合物, 特别优选化合物 I.115.1-I.115.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.115.1-I.115.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5-氯呋喃-2-基。

[0342] 同样优选式 I.116 化合物, 特别优选化合物 I.116.1-I.116.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.116.1-I.116.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3-氟呋喃-2-基。

[0343] 同样优选式 I.117 化合物, 特别优选化合物 I.117.1-I.117.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.117.1-I.117.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-氟呋喃-2-基。

[0344] 同样优选式 I.118 化合物, 特别优选化合物 I.118.1-I.118.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.118.1-I.118.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5-氟呋喃-2-基。

[0345] 同样优选式 I.119 化合物, 特别优选化合物 I.119.1-I.119.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.119.1-I.119.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为呋喃-3-基。

[0346] 同样优选式 I.120 化合物, 特别优选化合物 I.120.1-I.120.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.120.1-I.120.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-氯呋喃-3-基。

[0347] 同样优选式 I.121 化合物, 特别优选化合物 I.121.1-I.121.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.121.1-I.121.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-氯呋喃-3-基。

[0348] 同样优选式 I.122 化合物, 特别优选化合物 I.122.1-I.122.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.122.1-I.122.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5-氯呋喃-3-基。

[0349] 同样优选式 I.123 化合物, 特别优选化合物 I.123.1-I.123.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.123.1-I.123.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-氟呋喃-3-基。

[0350] 同样优选式 I.124 化合物, 特别优选化合物 I.124.1-I.124.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.124.1-I.124.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-氟呋喃-3-基。

[0351] 同样优选式 I.125 化合物, 特别优选化合物 I.125.1-I.125.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.125.1-I.125.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5-氟呋喃-3-基。

[0352] 同样优选式 I.126 化合物, 特别优选化合物 I.126.1-I.126.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.126.1-I.126.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5-氟呋喃-3-基。

[0353] 同样优选式 I.127 化合物, 特别优选化合物 I.127.1-I.127.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.127.1-I.127.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于 R^1 为 CH_3 。

[0354] 同样优选式 I.128 化合物, 特别优选化合物 I.128.1-I.128.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.128.1-I.128.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-氯苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0355] 同样优选式 I.129 化合物, 特别优选化合物 I.129.1-I.129.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.129.1-I.129.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3-氯苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0356] 同样优选式 I.130 化合物, 特别优选化合物 I.130.1-I.130.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.130.1-I.130.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-氯苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0357] 同样优选式 I.131 化合物, 特别优选化合物 I.131.1-I.131.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.131.1-I.131.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-三氟甲基苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0358] 同样优选式 I.132 化合物, 特别优选化合物 I.132.1-I.132.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.132.1-I.132.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3-三氟甲基苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0359] 同样优选式 I.133 化合物, 特别优选化合物 I.133.1-I.133.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.133.1-I.133.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-三氟甲基苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0360] 同样优选式 I.134 化合物, 特别优选化合物 I.134.1-I.134.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.134.1-I.134.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-甲氧基苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0361] 同样优选式 I.135 化合物, 特别优选化合物 I.135.1-I.135.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.135.1-I.135.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3-甲氧基苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0362] 同样优选式 I.136 化合物, 特别优选化合物 I.136.1-I.136.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.136.1-I.136.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-甲氧基苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0363] 同样优选式 I.137 化合物, 特别优选化合物 I.137.1-I.137.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.137.1-I.137.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-氟苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0364] 同样优选式 I.138 化合物, 特别优选化合物 I.138.1-I.138.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.138.1-I.138.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3-氟苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0365] 同样优选式 I.139 化合物, 特别优选化合物 I.139.1-I.139.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.139.1-I.139.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-氟苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0366] 同样优选式 I.140 化合物, 特别优选化合物 I.140.1-I.140.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.140.1-I.140.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-甲基苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0367] 同样优选式 I. 141 化合物, 特别优选化合物 I. 141. 1-I. 141. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 141. 1-I. 141. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 甲基苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0368] 同样优选式 I. 142 化合物, 特别优选化合物 I. 142. 1-I. 142. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 142. 1-I. 142. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 甲基苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0369] 同样优选式 I. 143 化合物, 特别优选化合物 I. 143. 1-I. 143. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 143. 1-I. 143. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯-3- 甲基苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0370] 同样优选式 I. 144 化合物, 特别优选化合物 I. 144. 1-I. 144. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 144. 1-I. 144. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯-4- 甲基苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0371] 同样优选式 I. 145 化合物, 特别优选化合物 I. 145. 1-I. 145. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 145. 1-I. 145. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯-5- 甲基苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0372] 同样优选式 I. 146 化合物, 特别优选化合物 I. 146. 1-I. 146. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 146. 1-I. 146. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯-6- 甲基苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0373] 同样优选式 I. 147 化合物, 特别优选化合物 I. 147. 1-I. 147. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 147. 1-I. 147. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2,3- 二氯苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0374] 同样优选式 I. 148 化合物, 特别优选化合物 I. 148. 1-I. 148. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 148. 1-I. 148. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2,4- 二氯苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0375] 同样优选式 I. 149 化合物, 特别优选化合物 I. 149. 1-I. 149. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 149. 1-I. 149. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2,5- 二氯苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0376] 同样优选式 I. 150 化合物, 特别优选化合物 I. 150. 1-I. 150. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 150. 1-I. 150. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2,6- 二氯苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0377] 同样优选式 I. 151 化合物, 特别优选化合物 I. 151. 1-I. 151. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 151. 1-I. 151. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯-3- 氟苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0378] 同样优选式 I. 152 化合物, 特别优选化合物 I. 152. 1-I. 152. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 152. 1-I. 152. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯-4- 氟苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0379] 同样优选式 I. 153 化合物, 特别优选化合物 I. 153. 1-I. 153. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 153. 1-I. 153. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯-5- 氟苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0380] 同样优选式 I. 154 化合物, 特别优选化合物 I. 154. 1-I. 154. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 154. 1-I. 154. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-氯-6-氟苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0381] 同样优选式 I. 155 化合物, 特别优选化合物 I. 155. 1-I. 155. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 155. 1-I. 155. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2,3-二氟苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0382] 同样优选式 I. 156 化合物, 特别优选化合物 I. 156. 1-I. 156. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 156. 1-I. 156. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2,4-二氟苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0383] 同样优选式 I. 157 化合物, 特别优选化合物 I. 157. 1-I. 157. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 157. 1-I. 157. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2,5-二氟苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0384] 同样优选式 I. 158 化合物, 特别优选化合物 I. 158. 1-I. 158. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 158. 1-I. 158. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2,6-二氟苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0385] 同样优选式 I. 159 化合物, 特别优选化合物 I. 159. 1-I. 159. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 159. 1-I. 159. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-氟-3-氯苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0386] 同样优选式 I. 160 化合物, 特别优选化合物 I. 160. 1-I. 160. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 160. 1-I. 160. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-氟-4-氯苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0387] 同样优选式 I. 161 化合物, 特别优选化合物 I. 161. 1-I. 161. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 161. 1-I. 161. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-氟-5-氯苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0388] 同样优选式 I. 162 化合物, 特别优选化合物 I. 162. 1-I. 162. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 162. 1-I. 162. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3,4-二氟苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0389] 同样优选式 I. 163 化合物, 特别优选化合物 I. 163. 1-I. 163. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 163. 1-I. 163. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3,5-二氟苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0390] 同样优选式 I. 164 化合物, 特别优选化合物 I. 164. 1-I. 164. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 164. 1-I. 164. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3,4-二氯苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0391] 同样优选式 I. 165 化合物, 特别优选化合物 I. 165. 1-I. 165. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 165. 1-I. 165. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3,5-二氯苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0392] 同样优选式 I. 166 化合物, 特别优选化合物 I. 166. 1-I. 166. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 166. 1-I. 166. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3-氟,4-氯苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0393] 同样优选式 I. 167 化合物, 特别优选化合物 I. 167. 1-I. 167. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 167. 1-I. 167. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氟, 3- 氯苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0394] 同样优选式 I. 168 化合物, 特别优选化合物 I. 168. 1-I. 168. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 168. 1-I. 168. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氟, 5- 氯苯基且 R^1 为 CH_3 。

[0395] 同样优选式 I. 169 化合物, 特别优选化合物 I. 169. 1-I. 169. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 169. 1-I. 169. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为吡啶 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0396] 同样优选式 I. 170 化合物, 特别优选化合物 I. 170. 1-I. 170. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 170. 1-I. 170. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氯吡啶 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0397] 同样优选式 I. 171 化合物, 特别优选化合物 I. 171. 1-I. 171. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 171. 1-I. 171. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氯吡啶 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0398] 同样优选式 I. 172 化合物, 特别优选化合物 I. 172. 1-I. 172. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 172. 1-I. 172. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 氯吡啶 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0399] 同样优选式 I. 173 化合物, 特别优选化合物 I. 173. 1-I. 173. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 173. 1-I. 173. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6- 氯吡啶 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0400] 同样优选式 I. 174 化合物, 特别优选化合物 I. 174. 1-I. 174. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 174. 1-I. 174. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 三氟甲基吡啶 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0401] 同样优选式 I. 175 化合物, 特别优选化合物 I. 175. 1-I. 175. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 175. 1-I. 175. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 三氟甲基吡啶 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0402] 同样优选式 I. 176 化合物, 特别优选化合物 I. 176. 1-I. 176. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 176. 1-I. 176. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 三氟甲基吡啶 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0403] 同样优选式 I. 177 化合物, 特别优选化合物 I. 177. 1-I. 177. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 177. 1-I. 177. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6- 三氟甲基吡啶 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0404] 同样优选式 I. 178 化合物, 特别优选化合物 I. 178. 1-I. 178. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 178. 1-I. 178. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 甲氧基吡啶 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0405] 同样优选式 I. 179 化合物, 特别优选化合物 I. 179. 1-I. 179. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 179. 1-I. 179. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 甲氧基吡啶 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0406] 同样优选式 I.180 化合物, 特别优选化合物 I.180.1-I.180.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.180.1-I.180.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5-甲氧基吡啶-2-基且 R^1 为 CH_3 。

[0407] 同样优选式 I.181 化合物, 特别优选化合物 I.181.1-I.181.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.181.1-I.181.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6-甲氧基吡啶-2-基且 R^1 为 CH_3 。

[0408] 同样优选式 I.182 化合物, 特别优选化合物 I.182.1-I.182.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.182.1-I.182.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3-氟吡啶-2-基且 R^1 为 CH_3 。

[0409] 同样优选式 I.183 化合物, 特别优选化合物 I.183.1-I.183.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.183.1-I.183.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-氟吡啶-2-基且 R^1 为 CH_3 。

[0410] 同样优选式 I.184 化合物, 特别优选化合物 I.184.1-I.184.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.184.1-I.184.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5-氟吡啶-2-基且 R^1 为 CH_3 。

[0411] 同样优选式 I.185 化合物, 特别优选化合物 I.185.1-I.185.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.185.1-I.185.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6-氟吡啶-2-基且 R^1 为 CH_3 。

[0412] 同样优选式 I.186 化合物, 特别优选化合物 I.186.1-I.186.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.186.1-I.186.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为吡啶-3-基且 R^1 为 CH_3 。

[0413] 同样优选式 I.187 化合物, 特别优选化合物 I.187.1-I.187.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.187.1-I.187.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-氯吡啶-3-基且 R^1 为 CH_3 。

[0414] 同样优选式 I.188 化合物, 特别优选化合物 I.188.1-I.188.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.188.1-I.188.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-氯吡啶-3-基且 R^1 为 CH_3 。

[0415] 同样优选式 I.189 化合物, 特别优选化合物 I.189.1-I.189.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.189.1-I.189.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5-氯吡啶-3-基且 R^1 为 CH_3 。

[0416] 同样优选式 I.190 化合物, 特别优选化合物 I.190.1-I.190.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.190.1-I.190.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6-氯吡啶-3-基且 R^1 为 CH_3 。

[0417] 同样优选式 I.191 化合物, 特别优选化合物 I.191.1-I.191.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.191.1-I.191.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-三氟甲基吡啶-3-基且 R^1 为 CH_3 。

[0418] 同样优选式 I.192 化合物, 特别优选化合物 I.192.1-I.192.2922, 尤其是化合物 (S, S)-I.192.1-I.192.2922, 它们与对应化合物 I.1.1-I.1.2922 或 (S, S)-I.1.1-I.1.2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-三氟甲基吡啶-3-基且 R^1 为 CH_3 。

[0419] 同样优选式 I. 193 化合物, 特别优选化合物 I. 193. 1-I. 193. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 193. 1-I. 193. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 三氟甲基吡啶 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0420] 同样优选式 I. 194 化合物, 特别优选化合物 I. 194. 1-I. 194. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 194. 1-I. 194. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6- 三氟甲基吡啶 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0421] 同样优选式 I. 195 化合物, 特别优选化合物 I. 195. 1-I. 195. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 195. 1-I. 195. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 甲氧基吡啶 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0422] 同样优选式 I. 196 化合物, 特别优选化合物 I. 196. 1-I. 196. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 196. 1-I. 196. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 甲氧基吡啶 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0423] 同样优选式 I. 197 化合物, 特别优选化合物 I. 197. 1-I. 197. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 197. 1-I. 197. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 甲氧基吡啶 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0424] 同样优选式 I. 198 化合物, 特别优选化合物 I. 198. 1-I. 198. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 198. 1-I. 198. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6- 甲氧基吡啶 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0425] 同样优选式 I. 199 化合物, 特别优选化合物 I. 199. 1-I. 199. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 199. 1-I. 199. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氟吡啶 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0426] 同样优选式 I. 200 化合物, 特别优选化合物 I. 200. 1-I. 200. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 200. 1-I. 200. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氟吡啶 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0427] 同样优选式 I. 201 化合物, 特别优选化合物 I. 201. 1-I. 201. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 201. 1-I. 201. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 氟吡啶 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0428] 同样优选式 I. 202 化合物, 特别优选化合物 I. 202. 1-I. 202. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 202. 1-I. 202. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 6- 氟吡啶 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0429] 同样优选式 I. 203 化合物, 特别优选化合物 I. 203. 1-I. 203. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 203. 1-I. 203. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为吡啶 -4- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0430] 同样优选式 I. 204 化合物, 特别优选化合物 I. 204. 1-I. 204. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 204. 1-I. 204. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氟吡啶 -4- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0431] 同样优选式 I. 205 化合物, 特别优选化合物 I. 205. 1-I. 205. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 205. 1-I. 205. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氟吡啶 -4- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0432] 同样优选式 I. 206 化合物, 特别优选化合物 I. 206. 1-I. 206. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 206. 1-I. 206. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 甲氧基吡啶 -4- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0433] 同样优选式 I. 207 化合物, 特别优选化合物 I. 207. 1-I. 207. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 207. 1-I. 207. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 甲氧基吡啶 -4- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0434] 同样优选式 I. 208 化合物, 特别优选化合物 I. 208. 1-I. 208. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 208. 1-I. 208. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 三氟甲基吡啶 -4- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0435] 同样优选式 I. 209 化合物, 特别优选化合物 I. 209. 1-I. 209. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 209. 1-I. 209. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 三氟甲基吡啶 -4- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0436] 同样优选式 I. 210 化合物, 特别优选化合物 I. 210. 1-I. 210. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 210. 1-I. 210. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯吡啶 -4- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0437] 同样优选式 I. 211 化合物, 特别优选化合物 I. 211. 1-I. 211. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 211. 1-I. 211. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氯吡啶 -4- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0438] 同样优选式 I. 212 化合物, 特别优选化合物 I. 212. 1-I. 212. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 212. 1-I. 212. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 噻吩 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0439] 同样优选式 I. 213 化合物, 特别优选化合物 I. 213. 1-I. 213. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 213. 1-I. 213. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氯噻吩 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0440] 同样优选式 I. 214 化合物, 特别优选化合物 I. 214. 1-I. 214. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 214. 1-I. 214. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氯噻吩 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0441] 同样优选式 I. 215 化合物, 特别优选化合物 I. 215. 1-I. 215. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 215. 1-I. 215. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 氯噻吩 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0442] 同样优选式 I. 216 化合物, 特别优选化合物 I. 216. 1-I. 216. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 216. 1-I. 216. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 三氟甲基噻吩 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0443] 同样优选式 I. 217 化合物, 特别优选化合物 I. 217. 1-I. 217. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 217. 1-I. 217. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 三氟甲基噻吩 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0444] 同样优选式 I. 218 化合物, 特别优选化合物 I. 218. 1-I. 218. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 218. 1-I. 218. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 三氟甲基噻吩 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0445] 同样优选式 I. 219 化合物, 特别优选化合物 I. 219. 1-I. 219. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 219. 1-I. 219. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 甲氧基噻吩 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0446] 同样优选式 I. 220 化合物, 特别优选化合物 I. 220. 1-I. 220. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 220. 1-I. 220. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 甲氧基噻吩 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0447] 同样优选式 I. 221 化合物, 特别优选化合物 I. 221. 1-I. 221. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 221. 1-I. 221. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 甲氧基噻吩 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0448] 同样优选式 I. 222 化合物, 特别优选化合物 I. 222. 1-I. 222. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 222. 1-I. 222. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氟噻吩 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0449] 同样优选式 I. 223 化合物, 特别优选化合物 I. 223. 1-I. 223. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 223. 1-I. 223. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氟噻吩 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0450] 同样优选式 I. 224 化合物, 特别优选化合物 I. 224. 1-I. 224. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 224. 1-I. 224. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 氟噻吩 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0451] 同样优选式 I. 225 化合物, 特别优选化合物 I. 225. 1-I. 225. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 225. 1-I. 225. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为噻吩 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0452] 同样优选式 I. 226 化合物, 特别优选化合物 I. 226. 1-I. 226. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 226. 1-I. 226. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氯噻吩 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0453] 同样优选式 I. 227 化合物, 特别优选化合物 I. 227. 1-I. 227. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 227. 1-I. 227. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氯噻吩 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0454] 同样优选式 I. 228 化合物, 特别优选化合物 I. 228. 1-I. 228. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 228. 1-I. 228. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 氯噻吩 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0455] 同样优选式 I. 229 化合物, 特别优选化合物 I. 229. 1-I. 229. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 229. 1-I. 229. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 氟噻吩 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0456] 同样优选式 I. 230 化合物, 特别优选化合物 I. 230. 1-I. 230. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 230. 1-I. 230. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氟噻吩 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0457] 同样优选式 I. 231 化合物, 特别优选化合物 I. 231. 1-I. 231. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 231. 1-I. 231. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 氟噻吩 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0458] 同样优选式 I. 232 化合物, 特别优选化合物 I. 232. 1-I. 232. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 232. 1-I. 232. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 甲氧基噻吩 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0459] 同样优选式 I. 233 化合物, 特别优选化合物 I. 233. 1-I. 233. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 233. 1-I. 233. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 甲氧基噻吩 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0460] 同样优选式 I. 234 化合物, 特别优选化合物 I. 234. 1-I. 234. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 234. 1-I. 234. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 甲氧基噻吩 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0461] 同样优选式 I. 235 化合物, 特别优选化合物 I. 235. 1-I. 235. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 235. 1-I. 235. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2- 三氟甲基噻吩 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0462] 同样优选式 I. 236 化合物, 特别优选化合物 I. 236. 1-I. 236. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 236. 1-I. 236. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 三氟甲基噻吩 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0463] 同样优选式 I. 237 化合物, 特别优选化合物 I. 237. 1-I. 237. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 237. 1-I. 237. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 三氟甲基噻吩 -3- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0464] 同样优选式 I. 238 化合物, 特别优选化合物 I. 238. 1-I. 238. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 238. 1-I. 238. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 呋喃 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0465] 同样优选式 I. 239 化合物, 特别优选化合物 I. 239. 1-I. 239. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 239. 1-I. 239. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氯呋喃 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0466] 同样优选式 I. 240 化合物, 特别优选化合物 I. 240. 1-I. 240. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 240. 1-I. 240. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氯呋喃 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0467] 同样优选式 I. 241 化合物, 特别优选化合物 I. 241. 1-I. 241. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 241. 1-I. 241. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 氯呋喃 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0468] 同样优选式 I. 242 化合物, 特别优选化合物 I. 242. 1-I. 242. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 242. 1-I. 242. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 3- 氟呋喃 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0469] 同样优选式 I. 243 化合物, 特别优选化合物 I. 243. 1-I. 243. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 243. 1-I. 243. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4- 氟呋喃 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0470] 同样优选式 I. 244 化合物, 特别优选化合物 I. 244. 1-I. 244. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 244. 1-I. 244. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5- 氟呋喃 -2- 基且 R^1 为 CH_3 。

[0471] 同样优选式 I. 245 化合物, 特别优选化合物 I. 245. 1-I. 245. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 245. 1-I. 245. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为呋喃-3-基且 R^1 为 CH_3 。

[0472] 同样优选式 I. 246 化合物, 特别优选化合物 I. 246. 1-I. 246. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 246. 1-I. 246. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-氯呋喃-3-基且 R^1 为 CH_3 。

[0473] 同样优选式 I. 247 化合物, 特别优选化合物 I. 247. 1-I. 247. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 247. 1-I. 247. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-氯呋喃-3-基且 R^1 为 CH_3 。

[0474] 同样优选式 I. 248 化合物, 特别优选化合物 I. 248. 1-I. 248. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 248. 1-I. 248. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5-氯呋喃-3-基且 R^1 为 CH_3 。

[0475] 同样优选式 I. 249 化合物, 特别优选化合物 I. 249. 1-I. 249. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 249. 1-I. 249. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 2-氟呋喃-3-基且 R^1 为 CH_3 。

[0476] 同样优选式 I. 250 化合物, 特别优选化合物 I. 250. 1-I. 250. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 250. 1-I. 250. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 4-氟呋喃-3-基且 R^1 为 CH_3 。

[0477] 同样优选式 I. 251 化合物, 特别优选化合物 I. 251. 1-I. 251. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 251. 1-I. 251. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5-氟呋喃-3-基且 R^1 为 CH_3 。

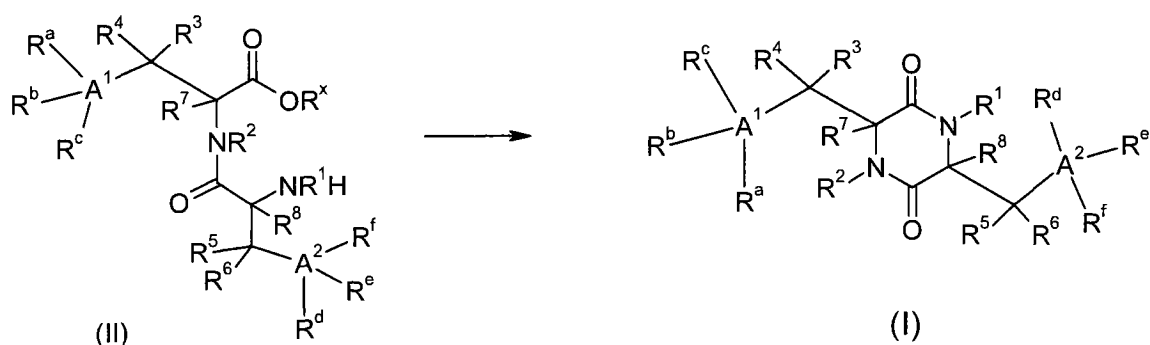
[0478] 同样优选式 I. 252 化合物, 特别优选化合物 I. 252. 1-I. 252. 2922, 尤其是化合物 (S, S)-I. 252. 1-I. 252. 2922, 它们与对应化合物 I. 1. 1-I. 1. 2922 或 (S, S)-I. 1. 1-I. 1. 2922 的不同在于基团 $A^2R^dR^eR^f$ 为 5-氟呋喃-3-基且 R^1 为 CH_3 。

[0479] 式 I 的哌嗪化合物可以通过用于由各种途径合成有机化合物的标准方法制备, 例如通过下面更详细说明的方法制备:

[0480] 方法 A

[0481] 式 I 化合物例如可以类似于由文献已知的方法通过使式 II 的对应二肽前体环化而制备, 例如类似于如下文献所述的方法而制备: T. Kawasaki 等人, Org. Lett. 2(19) (2000), 3027-3029, Igor L. Rodionov 等人, Tetrahedron 58(42) (2002), 8515-8523 或 A. L. Johnson 等人, Tetrahedron 60(2004), 961-965。在下文中, 式 II 的二肽的环化为本发明化合物也称为方法 A 且以下述方案描述:

[0482]



[0483] 在式 II 中, 变量 A^1 、 A^2 、 R^1 、 R^8 、 R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 如对式 I 所定义。基团 OR^x 为经由氧连接的合适的离去基团。此处, R^x 例如为 C_1 - C_6 烷基, 尤其是甲基或乙基或苯基- C_1 - C_6 烷基, 例如苄基。通式 II 的二肽是新的且也形成本发明主题的一部分。

[0484] 环化可例如通过使式 II 的二肽在酸或碱存在下 (酸环化或碱环化) 或通过加热反应混合物 (热环化) 反应而进行。

[0485] 碱或酸以等摩尔量或过量加入二肽 II 中。在本发明方法的特定实施方案中, 碱或酸基于二肽以过量使用。

[0486] 在碱存在下的二肽 II 的反应通常在 0°C 至反应混合物的沸点, 优选 10 - 50°C , 特别优选 15 - 35°C 的温度下进行。该反应通常在溶剂, 优选惰性有机溶剂中进行。

[0487] 合适的惰性有机溶剂包括脂族烃类, 如戊烷、己烷、环己烷和 C_5 - C_8 链烷烃的混合物, 芳族烃类, 如甲苯、邻二甲苯、间二甲苯和对二甲苯, 卤代烃类, 如二氯甲烷、二氯乙烷、氯仿和氯苯, 醚类, 如乙醚、二异丙基醚、叔丁基甲基醚、二噁烷、茴香醚和四氢呋喃, 腈类, 如乙腈和丙腈, 酮类, 如丙酮、甲基乙基酮、二乙基酮和叔丁基甲基酮, 醇类, 如甲醇、乙醇、正丙醇、异丙醇、正丁醇、叔丁醇, 水以及二甲亚砜、二甲基甲酰胺和二甲基乙酰胺, 还有吗啉和 N-甲基吗啉。还可以使用所述溶剂的混合物。

[0488] 在本发明的优选实施方案中, 该反应在使用例如 $1 : 10$ - $10 : 1$ 的混合比 (体积份数) 的四氢呋喃-水混合物中进行。

[0489] 合适的碱通常是无机化合物如碱金属和碱土金属氢氧化物, 如氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾或氢氧化钙, 氨水溶液, 碱金属或碱土金属氧化物, 如氧化锂、氧化钠、氧化钙和氧化镁, 碱金属和碱土金属氢化物, 如氢化锂、氢化钠、氢化钾和氢化钙, 碱金属氮化物, 如氮化锂, 例如二异丙基氨基锂, 氮化钠和氮化钾, 碱金属和碱土金属碳酸盐, 如碳酸锂、碳酸钾、碳酸铯和碳酸钙, 还有碱金属碳酸氢盐, 如碳酸氢钠, 有机金属化合物, 尤其是碱金属烷基化物, 如甲基锂、丁基锂和苯基锂, 烷基卤化镁, 如甲基氯化镁, 以及碱金属和碱土金属醇盐, 如甲醇钠、乙醇钠、乙醇钾、叔丁醇钾、叔戊醇钾和二甲氧基镁, 此外还有有机碱, 例如叔胺类, 如三甲胺、三乙胺、二异丙基乙基胺、2-羟基吡啶和 N-甲基哌啶, 吡啶, 取代吡啶, 如可力丁、卢剔啶和 4-二甲基氨基吡啶, 还有双环胺类。当然还可以使用不同碱的混合物。

[0490] 在本发明方法的一个实施方案中, II 的反应在碱, 优选叔丁醇钾、2-羟基吡啶或氨水溶液作为碱或这些碱的混合物存在下进行。优选仅使用这些碱中的一种。在特别优选的实施方案中, 该反应在氨水溶液中进行, 该溶液的浓度例如可以为 10 - 50% (w/v)。

[0491] II 在酸存在下的反应通常在 10°C 至反应混合物的沸点, 优选 50°C 至该沸点的温度下, 特别优选在该沸点下在回流下进行。该反应通常在溶剂, 优选惰性有机溶剂中进行。

[0492] 合适的溶剂原则上是也可以用于碱性环化的所有那些溶剂, 尤其是醇类。在优选

实施方案中,该反应在正丁醇中进行。

[0493] 对 II 的环化合适的酸原则上是布朗斯台德酸和路易斯酸。尤其可以使用无机酸,例如氢卤酸,如氢氟酸、盐酸、氢溴酸,无机含氧酸,如硫酸和高氯酸,此外还有无机路易斯酸,如三氟化硼、三氯化铝、氯化铁 (III)、氯化锡 (IV)、氯化钛 (IV) 和氯化锌 (II),以及有机酸,例如羧酸和羟基羧酸,如甲酸、乙酸、丙酸、草酸、柠檬酸和三氟乙酸,还有有机磺酸,如甲苯磺酸、苯磺酸、樟脑磺酸等。当然还可以使用不同酸的混合物。

[0494] 在本发明方法的一个实施方案中,该反应在有机酸,例如羧酸,如甲酸、乙酸或三氟乙酸或这些酸的混合物存在下进行。优选仅使用这些酸中的一种。在优选实施方案中,该反应在乙酸中进行。

[0495] 酸性环化的特别优选实施方案在正丁醇、N- 甲基吗啉和乙酸存在下在回流条件下进行。

[0496] 在本发明的另一实施方案中,该反应仅通过加热反应混合物而进行(热环化)。此时该反应通常在 10°C 至反应混合物的沸点,优选 50°C 至反应混合物的沸点的温度下,特别优选在该反应混合物的沸点下在回流下进行。该反应通常在溶剂,优选惰性有机溶剂中进行。

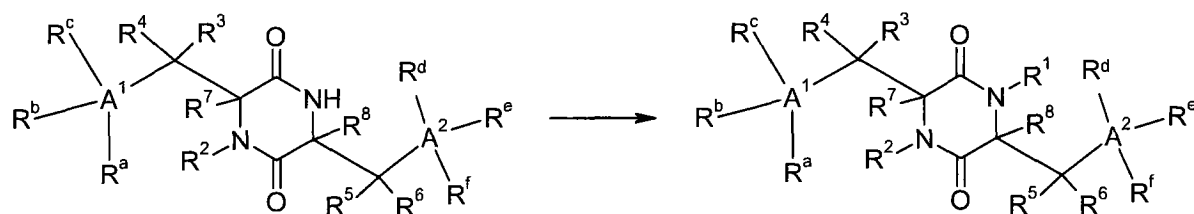
[0497] 合适的溶剂原则上是可以用于碱性环化的那些溶剂。优选极性非质子溶剂,例如二甲亚砜或二甲基甲酰胺或其混合物。在优选实施方案中,该反应在二甲亚砜中进行。

[0498] 在本发明方法 A 中得到的反应混合物例如可以常规方式后处理。这例如可以通过与水混合、分离各相并且合适的化层析提纯粗产物而进行。某些中间体和终产物以粘稠油形式得到,通常可以在减压和温和升高的温度下将它们提纯或从中除去挥发性组分。若中间体和终产物以固体得到,则还可以通过重结晶或浸煮进行提纯。

[0499] 方法 B

[0500] 根据本发明的另一方法(方法 B),其中 $R^1 \neq \text{H}$ 的式 I 的化合物也可通过使其中 R^1 为氢的式 I 的哌嗪化合物与含有不同于氢的基团 R^1 的烷基化剂或酰化剂反应而制备。该反应可类似于由文献已知的方法进行,例如根据由 I. O. Donkor 等人, Bioorg. Med. Chem. Lett. 11(19) (2001), 2647-2649, B. B. Snider 等人, Tetrahedron 57(16) (2001), 3301-3307, I. Yasuhiro 等人, J. Am. Chem. Soc. 124(47) (2002), 14017-14019 或 M. Falorni 等人, Europ. J. Org. Chem. (8) (2000), 1669-1675 所述的方法进行。

[0501]



义,其任选被卤素、 C_1-C_4 烷基或卤代 $-C_1-C_4$ 烷基取代。在酰化剂 X^2-R^1 中, X^2 可为卤素,尤其是 Cl。此处, $R^1 \neq$ 氢且如上所定义,尤其为 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_3-C_6 链烯基、 C_3-C_6 环烯基、 C_3-C_6 链炔基、 C_3-C_6 环炔基、苯基- (C_1-C_6) 烷基、杂环基、杂环基- (C_1-C_6) 烷基;苯基- $[C_1-C_6$ 烷氧羰基]- (C_1-C_6) 烷基或苯基杂环基- (C_1-C_6) 烷基;或 COR^{21} 或 SO_2R^{25} , 其中 R^1 的上述脂族、环状或芳族结构部分可部分或全部被卤代和/或可带有 1-3 个如下基团:氰基、羟基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 卤代烷基、 C_3-C_6 环烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、[二 (C_1-C_4) 烷基]-氨基、 C_1-C_4 烷基羰基、羟基羰基、 C_1-C_4 烷氧羰基、氨基羰基、 C_1-C_4 烷基氨基羰基、[二 (C_1-C_4) 烷基]氨基羰基或 C_1-C_4 烷基羰氧基。

[0504] 反应通常在 -78°C 至反应混合物沸点,优选 -50°C 至 65°C ,特别优选 -30°C 至 65°C 的温度下进行。通常而言,反应在溶剂中进行,优选在惰性有机溶剂中进行。

[0505] 合适的溶剂为在方法 A 中提到的化合物,尤其是甲苯、二氯甲烷、四氢呋喃或二甲基甲酰胺或其混合物。

[0506] 在本发明的优选实施方案中,反应在四氢呋喃中进行。

[0507] 在优选实施方案中,使其中 $R^1 = \text{H}$ 的化合物 I 与烷基化剂或酰化剂在碱存在下进行。合适的碱为在方法 A 中提到的化合物。通常而言,碱以等摩尔量使用。它们也可以过量使用或甚至作为溶剂使用。在本发明方法的优选实施方案中,碱以等摩尔量或以基本等摩尔量加入。在另一优选实施方案中,所用碱为氢化钠。

[0508] 后处理通常类似于在方法 A 中所述的程序进行。

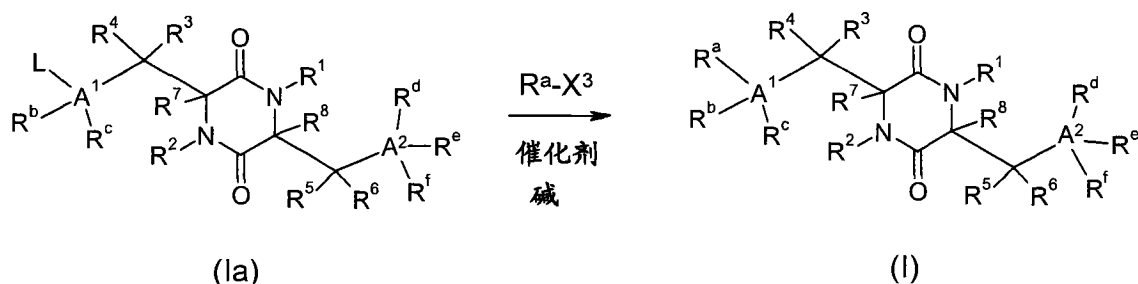
[0509] 方法 C

[0510] 类似于方法 B 中所述的程序,可使其中 R^2 为氢的化合物 I 与烷基化剂 R^2-X^1 或酰化剂 R^2-X^2 反应,得到其中 R^2 为氢的式 I 的化合物(方法 C)。根据本发明,方法 C 的反应条件对应于方法 B 的那些。

[0511] 方法 D

[0512] 根据下述方案所述的方法,可通过例如类似于 J. Tsuji, Top. Organomet. Chem. (14) (2005), 第 332 页及随后各页或 J. Tsuji, Organic Synthesis with Palladium compound. (1980), 第 207 页及随后各页和 Organikum, 第 21 版, 2001, Wiley 和其中所引用的文献所述的方法通过转化取代基 R^a 而制备式 I 的化合物:

[0513]



[0514] 为此,使式 Ia 的哌嗪化合物(具有合适的离去基团 L 代替取代基 R^a)

[0515] 通过与含有基团 R^a 的偶联剂(化合物 R^a-X^3)反应而转化为式 I 的另一哌嗪衍生物。

[0516] 反应通常在催化剂存在下,优选在过渡金属催化剂存在下进行。通常而言,反应在碱存在下进行。

[0517] 在下文中,该反应顺序使用取代基 R^a 的实例进行说明,并且当然可以类似的方式转化取代基 R^b 和 R^c 。

[0518] 合适的离去基团 L 例如为卤素,尤其是氯、溴或碘或 $S(O)_nR^k$, 其中 $n = 0, 1, 2$ 和 R^k 为 C_1-C_6 烷基、卤代 $-(C_1-C_6)$ 烷基或任选卤代或 C_1-C_4 烷基取代的芳基。

[0519] 合适的偶联剂 X^3-R^a 尤其为如下那些化合物,在该化合物中如果 R^a 为 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基、芳基或杂芳基,则 X^3 表示如下基团之一:

[0520] $-Zn-R^1$, 其中 R^1 为卤素、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 链烯基、芳基或杂芳基;

[0521] $-B(OR^m)_2$, 其中 R^m 为 H 或 C_1-C_6 烷基, 其中两个烷基取代基可一起形成 C_2-C_4 亚烷基链;或

[0522] $-SnR^n_3$, 其中 R^n 为 C_1-C_6 烷基或芳基。

[0523] 如果 R^a 为 C_2-C_6 链炔基, X^3 也可作为氢。

[0524] 为制备其中 R^a 为 CN 的化合物 I, 也可使其中 L 为溴或碘的化合物 Ia 与氰化铜类似于已知的方法(例如参见 Organikum, 第 21 版, 2001, Wiley, 第 404 页和其中引用的文献)反应。

[0525] 此处, 根据优选实施方案, 在式 I 化合物中的 L 或 R^a 在 A^1 的连接点的邻位与 A^1 的碳原子连接。

[0526] 该反应通常在 -78°C 至反应混合物沸点, 优选 -30°C 至 65°C , 特别优选 $30-65^\circ\text{C}$ 的温度下进行。通常而言, 反应在惰性溶剂中在碱存在下进行。

[0527] 合适的溶剂为在方法 A 中提到的化合物。在本发明方法的一个实施方案中, 使用具有催化量的水的四氢呋喃; 在另一实施方案中, 仅使用四氢呋喃。

[0528] 合适的碱为在方法 A 中提到的化合物。

[0529] 碱通常以等摩尔量使用。它们也可过量使用或甚至用作溶剂。

[0530] 在本发明方法的优选实施方案中, 碱以等摩尔量加入。在另一优选实施方案中, 所用碱为三乙胺或碳酸铯, 特别优选碳酸铯。

[0531] 适合本发明方法的催化剂原则上为过渡金属 Ni、Fe、Pd 或 Cu 的化合物。也可使用有机或无机化合物。例如可提及 $Pd(PPh_3)_2Cl_2$ 、 $Pd(OAc)_2$ 、 $PdCl_2$ 或 Na_2PdCl_4 。此处 Ph 为苯基。

[0532] 不同催化剂可单独使用或者以混合物使用。在本发明的一个优选实施方案中, 使用 $Pd(PPh_3)_2Cl_2$ 。

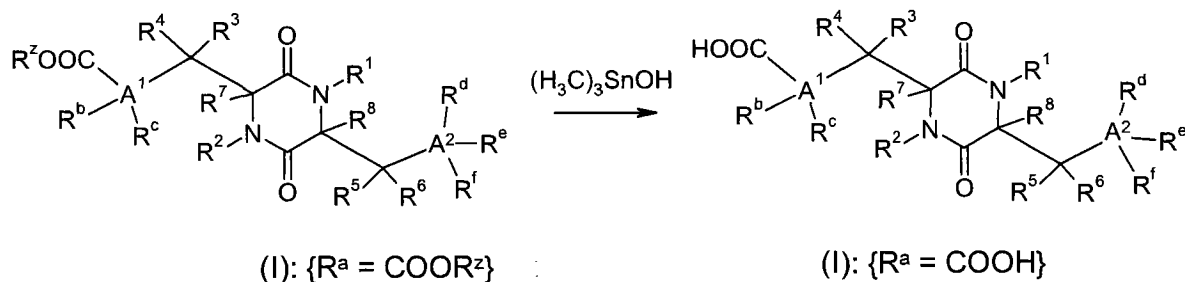
[0533] 后处理可类似于方法 A 所述的程序进行。

[0534] 方法 E

[0535] 其中基团 R^a 、 R^b 或 R^c 中的一个为 COOH 的式 I 的哌嗪化合物还可由其中 R^a 、 R^b 或 R^c 为 COOR^z 的式 I 的哌嗪化合物通过水解酯基而制备, 其中 R^z 为烷基, 例如 CH_3 。水解例如可通过与 $(H_3C)_3SnOH$, 例如根据 K. C. Nicolaou 等人, Angew. Chem. Int. Ed. Engl. (44) (2005), 1378 反应而进行。然而, 以此方式得到的羧酸可通过有机合成的标准方法, 合适的话在转化为酰氯之后通过与胺 HNR^uR^v 或醇 HOR^w 反应成对应的酯或酰胺, Organikum, Autorenkollektiv, Leipzig 1993, 第 19 版, 第 424-429 页。该反应顺序在下文中使用取代基 R^a 的实例进行说明, 当然该顺序也可以类似的方式适用于转化取代基 R^b 和 R^c 。

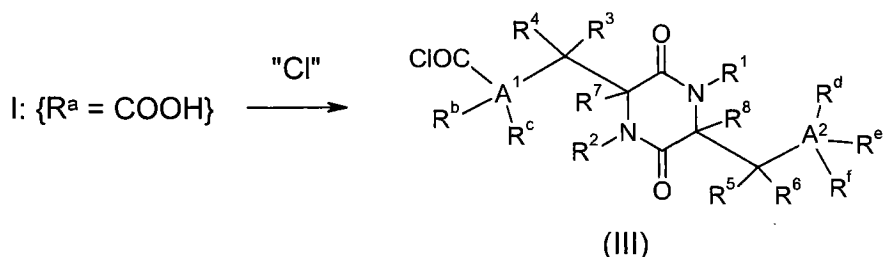
[0536] 步骤 1:

[0537]



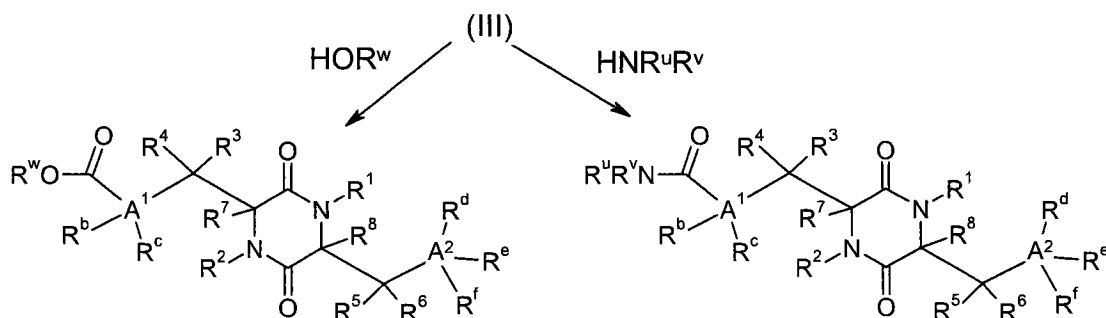
[0538] 步骤 2 :

[0539]



[0540] 步骤 3 :

[0541]



[0542] 在该方案中,变量 A¹、A²、R¹-R⁸、R^b、R^c、R^d、R^e 和 R^f 具有上述含义。R^u 和 R^v 相互独立地为氢、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 链烯基、C₂-C₆ 链炔基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 烷基磺酰基、C₁-C₆ 烷基氨基磺酰基、[二(C₁-C₆) 烷基氨基]磺酰基或任选被取代的苯基。R^w 为 C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 链烯基或 C₃-C₆ 链炔基。

[0543] 在第一步中,将哌嗪化合物 I 中的酯基 {R^a = COOR^z} 水解。水解例如可通过与 (H₃C)₃SnOH 反应而进行,这产生游离酸 I {R^a = COOH}。转化为游离酸通常使用过量 (H₃C)₃SnOH 进行。通常而言,反应在惰性有机溶剂中进行。合适的溶剂尤其包括二氯甲烷。通常而言,反应在升高温度,例如在约 80°C 下进行。

[0544] 在第二步中,将酸 I {R^a = COOH} 转化为式 III 的酰氯。转化为酰氯通常在 10-50°C 的温度,优选在室温下进行,例如在 25°C 下进行。通常而言,该反应在惰性有机溶剂中进行。最合适的溶剂尤其包括二氯甲烷。在优选实施方案中,该反应在二氯甲烷和催化量的二甲基甲酰胺中进行。大量试剂适于该氯化,例如草酰氯或亚硫酰氯。优选使用基本等摩尔量的氯化试剂,尤其是草酰氯。

[0545] 在随后的反应中与胺 HNR^uR^v 的反应通常通过加入过量的所述胺而进行。该反应可以在 0-40°C 的温度下,优选在室温下,例如在 25°C 下进行。

[0546] 在随后的反应中与醇 HOR^w 的反应通常通过加入过量的所述醇和三乙胺而进行。

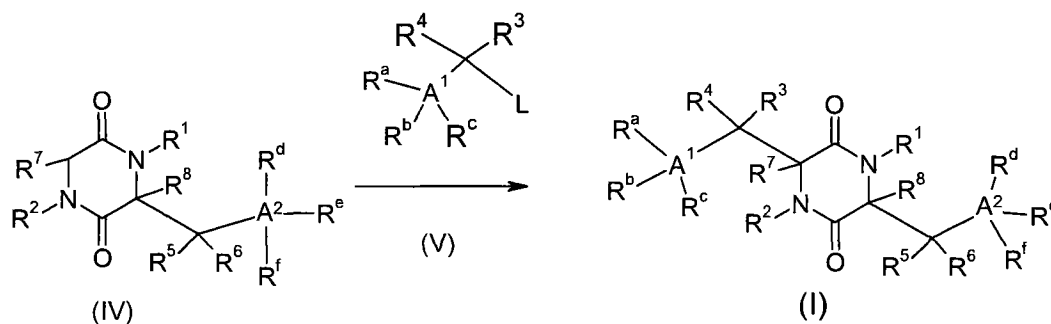
[0547] 该反应可以在 0-40℃ 的温度下, 优选在室温下, 例如在 25℃ 下进行。

[0548] 后处理可以类似于对方法 A 所述的程序进行。

[0549] 方法 F

[0550] 式 I 化合物可通过下面所示的合成用化合物 V 偶联通式 IV 的哌嗪化合物而制备。用 V 偶联 IV 可类似于由如下文献已知的方法而进行: 如 G. Porzi, 等人, *Tetrahedron Asymmetry* 9(19), (1998), 3411-3420 或 C. I. Harding 等人, *Tetrahedron* 60(35), (2004), 7679-7692 或 C. J. Chang 等人, *J. Chem. Soc. Perk. T. 1* (24), (1994), 3587-3593。

[0551]



[0552] 在该方案中, A^1 、 A^2 、 R^1 - R^8 、 R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 如上所定义。L 为合适的离去基团, 如卤素或 OSO_2R^m , 其中 R^m 为 C_1 - C_4 烷基、芳基或被 C_1 - C_4 烷基单取代至三取代的芳基。

[0553] 通常而言, 反应在 -78℃ 至反应混合物的沸点, 优选 -78℃ 至 40℃, 特别优选 -78℃ 至 30℃ 的温度下进行。

[0554] 通常而言, 反应在惰性有机溶剂中在碱存在下进行。合适的溶剂为在方法 A 中提及的化合物。在本发明方法的优选实施方案中, 使用四氢呋喃。

[0555] 合适的碱为在方法 A 中提及的化合物。在另一优选实施方案中。所用碱为二异丙基氨基锂, 特别优选以基本等摩尔量, 尤其是以等摩尔量使用。

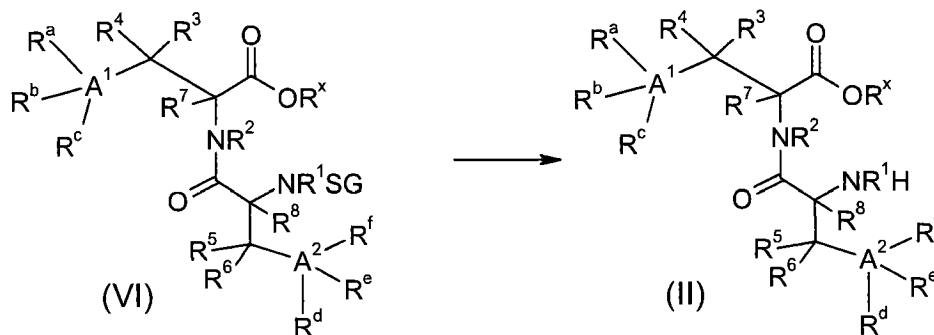
[0556] 一些式 V 的化合物可市购或可通过描述于文献中的转化相应的市售前体而制备。

[0557] 后处理可类似于对方法 A 所述的程序进行。

[0558] 制备式 I 化合物所需的某些前体和中间体可以市购、由文献已知或者可以通过由文献已知的方法制备。

[0559] 式的 II 二肽化合物例如可以类似于由文献已知的方法由通式 VI 的 N- 保护的二肽制备, 例如根据 Glenn L. Stahl 等, *J. Org. Chem.* 43(11), (1978), 2285-6 或 A. K. Ghosh 等, *Org. Lett.* 3(4), (2001), 635-638。

[0560]



[0561] 在式 II 和 VI 中, 变量 A^1 、 A^2 、 R^1 - R^8 、 R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 和 R^f 如对式 I 所定义、SG 为氮

保护基团,例如 Boc (=叔丁氧羰基),以及 OR^x 为经由氧原子连接的离去基团。当然,在每种情况下式 I 化合物的优选含义相应地应用于式 II 或 IV 化合物。对于离去基团 OR^x ,上面式 II 的二肽所述的那些适用。

[0562] 因此,例如可以在酸存在下将其中 SG 为 Boc 且 OR^x 为合适的离去基团的式 VI 的二肽转化成式 II 化合物,其中 R^x 例如为 C_1-C_6 烷基,尤其是甲基、乙基或苄基。

[0563] 该反应通常在 -30°C 至反应混合物的沸点,优选 $0-50^\circ\text{C}$,特别优选 $20-35^\circ\text{C}$ 的温度下进行。

[0564] 该反应可以在溶剂,尤其是惰性有机溶剂中进行。合适的溶剂原则上是对碱性环化所述的化合物,尤其是四氢呋喃或二氯甲烷或其混合物。在优选实施方案中,该反应在二氯甲烷中进行。

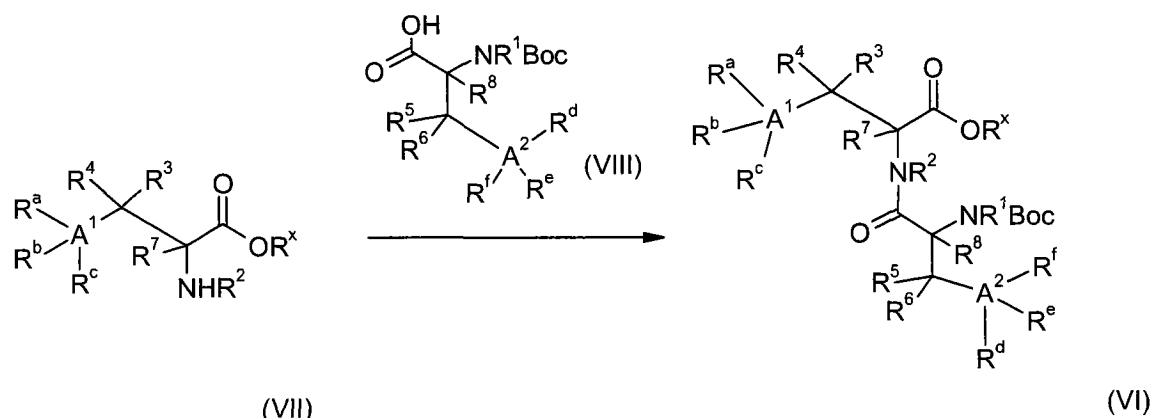
[0565] 所用酸是对方法 A 所述的酸。

[0566] 在本发明方法的一个实施方案中,该反应在有机酸,例如强有机酸如甲酸、乙酸或三氟乙酸或其混合物存在下进行。在优选实施方案中,该反应在三氟乙酸存在下进行。

[0567] 后处理可以类似于对方法 A 所述的程序进行。

[0568] 式 VI 的被保护二肽可以类似于由文献已知的方法制备,例如根据 Wilford L. Mendelson 等, *Int. J. Peptide & Protein Research* 35(3), (1990), 249-257 制备。典型的途径是用式 VII 的氨基酸酯将 Boc-保护的氨基酸 VIII 酰胺化,这如下列方案所示:

[0569]



[0570] 在该方案中,各变量如上所定义。代替 Boc,还可以使用其它氨基保护基团。

[0571] VII 与 VIII 的反应通常在 -30°C 至反应混合物的沸点,优选 $0-50^\circ\text{C}$,特别优选 $20-35^\circ\text{C}$ 的温度下进行。该反应可以在溶剂,优选惰性有机溶剂中进行。合适的溶剂是在方法 A 中就碱性环化所提到的溶剂。

[0572] 该反应通常要求存在活化剂。合适的活化剂是缩合剂,例如聚苯乙烯负载的或非聚苯乙烯负载的二环己基碳二亚胺 (DCC)、二异丙基碳二亚胺、1-乙基-3-(二甲基氨基丙基)碳二亚胺 (EDAC)、羰基二咪唑,氯代羧酸酯,如氯甲酸甲酯、氯甲酸乙酯、氯甲酸异丙基酯、氯甲酸异丁基酯、氯甲酸仲丁基酯或氯甲酸烯丙基酯,新戊酰氯,聚磷酸,丙烷膦酸酐,二(2-氧代-3-噁唑烷基)磷酰氯 (BOPCl) 或磺酰氯,如甲磺酰氯、甲苯磺酰氯或苯磺酰氯。根据一个实施方案,优选的活化剂是 EDAC 或 DCC。

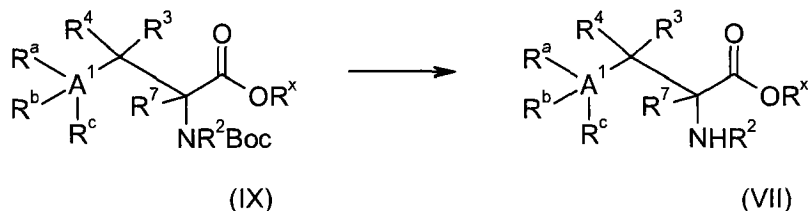
[0573] VII 与 VIII 的反应优选在碱存在下进行。合适的碱是在方法 A 中所述的化合物。在一个实施方案中,所用碱为三乙胺或 N-乙基二异丙基胺或其混合物,特别优选 N-乙基二

异丙基胺。

[0574] 后处理可以类似于对方法 A 所述的程序进行。

[0575] 式 VII 化合物本身可以通过类似于由文献已知的方法将对应的被保护氨基酸化合物 IX 去保护而制备,例如根据 Glenn L. Stahl 等, J. Org. Chem. 43(11), (1978), 2285-6 或 A. K. Ghosh 等, Org. Lett. 3(4), (2001), 635-638。由 Boc- 保护的氨基酸化合物 IX 制备 VII 如下列方案所示。除 Boc 基团外,也可使用其它氨基保护基团。

[0576]



[0577] 式 IX 化合物向化合物 VII 的转化通常在酸存在下在 -30°C 至反应混合物的沸点, 优选 $0-50^{\circ}\text{C}$, 特别优选 $20-35^{\circ}\text{C}$ 的温度下进行。该反应可以在溶剂, 优选惰性有机溶剂中进行。

[0578] 合适的溶剂原则上是在碱性环化下所述的化合物, 尤其是四氢呋喃或二氯甲烷或其混合物。在优选实施方案中, 该反应在二氯甲烷中进行。

[0579] 所用酸和酸性催化剂是对方法 A 所述的化合物。

[0580] 在本发明方法的一个实施方案中, 该反应在有机酸, 例如强有机酸, 如甲酸、乙酸或三氟乙酸或其混合物存在下进行。在优选实施方案中, 该反应在三氟乙酸存在下进行。

[0581] 后处理可以类似于对方法 A 所述的程序进行。

[0582] 式化合物 IX 可以根据下列方案所示反应制备。化合物 V 与被保护氨基酸化合物 X 的反应可以类似于由文献已知的方法进行, 例如根据 I. Ojima 等, J. Am. Chem. Soc., 109(21), (1987), 6537-6538 或 J. M. McIntosh 等, Tetrahedron 48(30), (1992), 6219-6224。

[0583]



[0584] 在该方案中, 各变量如上所定义。L 为离去基团, 例如对方法 F 提及的离去基团之一。代替 Boc, 还可以使用其它氨基保护基团。

[0585] V 与 X 的反应通常在碱存在下进行。合适的碱是对方法 A 所述的化合物。在另一优选实施方案中, 所用碱是二异丙基氨基锂, 特别优选以基本等摩尔量, 尤其是等摩尔量使用。

[0586] 该反应通常在 -78°C 至反应混合物的沸点, 优选 -78°C 至沸点, 特别优选 -78°C 至 30°C 的温度下进行。

[0587] 该反应可以在溶剂, 优选惰性有机溶剂中进行。合适的溶剂原则上是在碱性环化下提到的溶剂, 尤其是二氯甲烷或四氢呋喃或其混合物。在优选实施方案中, 该反应在四氢

呋喃中进行。

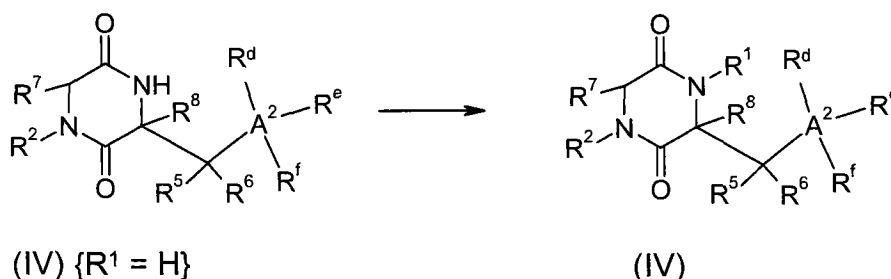
[0588] 后处理类似于对方法 A 所述的程序进行。

[0589] 某些式 V 化合物可以市购或者可以由文献中所述的对应市售前体的转化而制备。

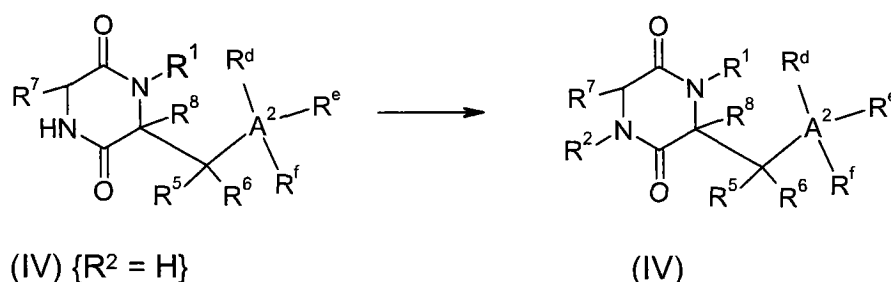
[0590] 一些式 VIII 或 X 的氨基酸衍生物或下述衍生物 XV 同样可市购或可以由文献中所述的对应市售前体的转化而制备。

[0591] 其中 $R^1 \neq$ 氢的式 IV 化合物还可以通过使其中 R^1 为氢的式 IV 的哌嗪化合物与含有不为氢的基团 R^1 的烷基化剂或酰化剂反应而制备。以类似的方式, 其中 $R^2 \neq$ 氢的式 IV 化合物还可以通过使其中 R^2 为氢的式 IV 的哌嗪化合物与含有不为氢的基团 R^2 的烷基化剂或酰化剂反应而制备。该类反应可以类似于由文献已知的方法进行, 例如根据 I. O. Donkor 等, Bioorg. Med. Chem. Lett. 11(19) (2001), 2647-2649, B. B. Snider 等, Tetrahedron 57(16) (2001), 3301-3307, I. Yasuhiro 等, J. Am. Chem. Soc. 124(47) (2002), 14017-14019 或 M. Falorni 等, Europ. J. Org. Chem. (8) (2000), 1669-1675 中所述的方法。

[0592]



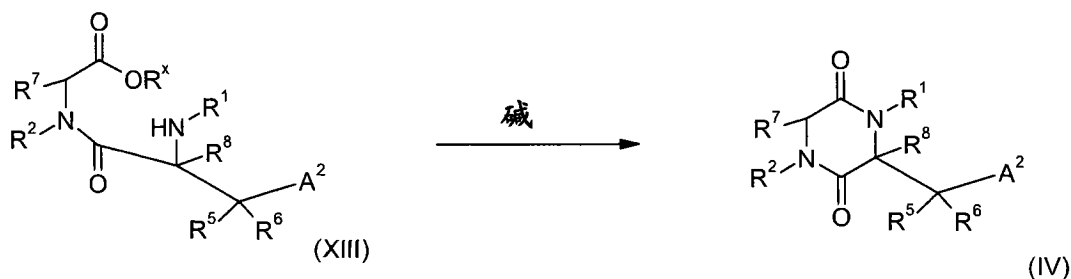
[0593]



[0594] 对于烷基化剂或酰化剂, 对方法 B 和 C 所述内容类似地适用。对于这些反应的反应条件, 对方法 B 和 C 所述内容类似地适用。

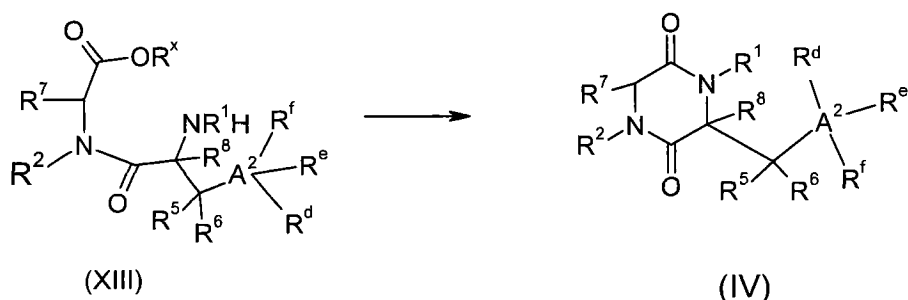
[0595] 式 IV 化合物也可通过由文献已知的其它方法使通式 XIII 的化合物的分子内环化而制备, 如根据 T. Kawasaki 等人, Org. Lett. 2(19) (2000), 3027-3029, 3027-3029, Igor L. Rodionov 等人, Tetrahedron 58(42) (2002), 8515-8523 或 A. L. Johnson 等人, Tetrahedron 60(2004), 961-965 的方法制备。

[0596]



[0597] 此处, OR^x 为合适的离去基团且 R^x 例如为 C_1-C_6 烷基, 尤其是甲基、乙基或苄基。

[0598]



[0599] 在式 XIII 中, 变量 R^x 、 A^2 、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^d 、 R^e 和 R^f 如对式 I 所定义。基团 OR^x 为经由氧连接的合适的离去基团。此处 R^x 例如为 C_1-C_6 烷基, 尤其是甲基或乙基或苄基 $-C_1-C_6$ 烷基, 例如苄基,

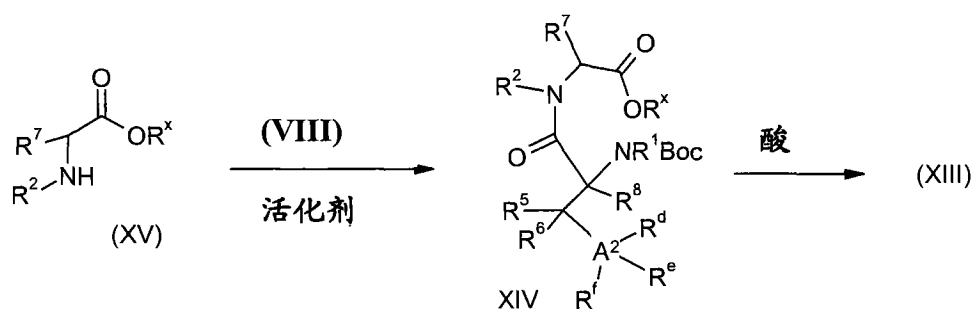
[0600] 式 XIII 化合物的环化可在碱存在下进行。此时, 反应通常在 0°C 至反应混合物的沸点, 优选 $10-50^\circ\text{C}$, 特别优选 $15-35^\circ\text{C}$ 的温度下进行。反应可在溶剂, 优选惰性有机溶剂中进行。

[0601] 合适的溶剂原则上是在热环化下提到的化合物, 尤其是混合比为 1 : 10-10 : 1 的四氢呋喃-水混合物。

[0602] 合适的碱是对方法 A 的碱性环化所提到的碱, 尤其是叔丁醇钾、2-羟基吡啶或氨的水溶液或这些碱的混合物。优选仅使用这些碱中的一种。在特别优选的实施方案中, 该反应在氨水溶液存在下进行, 该溶液的浓度例如可以为 10-50% (w/v)。

[0603] 式 XIII 化合物本身可以通过下列方案中所示的合成类似于由文献已知的方法制备, 例如根据 Wilford L. Mendelson 等, Int. J. Peptide & Protein Research 35(3), (1990), 249-257, Glenn L. Stahl 等, J. Org. Chem. 43(11), (1978), 2285-2286 或 A. K. Ghosh 等, Org. Lett. 3(4), (2001), 635-638。

[0604]



[0605] 在该方案中, 变量 R^x 、 A^2 、 R^1 、 R^2 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^d 、 R^e 和 R^f 如对式 II 或 XIII 所定义。在第一步中, 合成包括氨基酸化合物 XV 与 Boc 保护的氨基酸 VIII 在活化剂存在下的偶联。

[0606] 式 XV 化合物与式 VIII 化合物的反应通常在 -30°C 至反应混合物的沸点, 优选 $0-50^\circ\text{C}$, 特别优选 $20-35^\circ\text{C}$ 的温度下进行。该反应可以在溶剂, 优选惰性有机溶剂中进行。对于进一步的细节参考通过氨基酸化合物 VIII 与化合物 VII 的酰胺化制备化合物 VI。

[0607] 该反应通常要求存在活化剂。合适的活化剂是缩合剂, 如聚苯乙烯负载的或非聚苯乙烯负载的二环己基碳二亚胺 (DCC)、二异丙基碳二亚胺、1-乙基-3-(二甲基氨基丙基) 碳二亚胺 (EDAC)、羰基二咪唑, 氯代羧酸酯, 如氯甲酸甲酯、氯甲酸乙酯、氯甲酸异丙基

酯、氯甲酸异丁基酯、氯甲酸仲丁基酯或氯甲酸烯丙基酯，新戊酰氯，聚磷酸，丙烷膦酸酐，二(2-氧代-3-噁唑烷基)-磷酸氯(BOPCl)或磺酰氯，如甲烷磺酰氯，甲苯磺酰氯或苯磺酰氯。根据一个实施方案，优选的活化剂是EDAC或DCC。

[0608] XV与VIII的反应优选在碱存在下进行。

[0609] 合适的碱是在方法A下所述的化合物。在一个实施方案中，所用碱为三乙胺或N-乙基二异丙基胺或其混合物，特别优选N-乙基二异丙基胺。

[0610] 后处理可以类似于对方法A所述的程序进行。

[0611] 由化合物XIV得到化合物XIII的去保护通常通过用酸处理而进行。该反应通常在-30℃至反应混合物的沸点，优选0-50℃，特别优选20-35℃的温度下进行。该反应可以在溶剂，优选惰性有机溶剂中进行。

[0612] 合适的溶剂原则上是在方法A下就碱性环化所提到的溶剂，尤其是四氢呋喃或二氯甲烷或其混合物。在优选实施方案中，该反应在二氯甲烷中进行。

[0613] 所用酸是对方法A所提到的酸。有关进一步的细节还参考由VI得到化合物II的去保护。其中所提到的反应条件也适于对化合物XIV去保护。在本发明方法的一个实施方案中，该反应在有机酸，尤其是强有机酸存在下进行，例如在甲酸、乙酸或三氟乙酸或其混合物存在下进行。在优选实施方案中，该反应在三氟乙酸存在下进行。

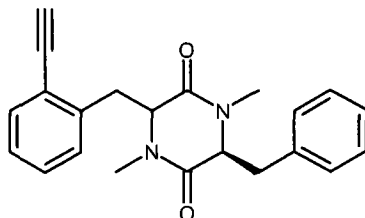
[0614] 后处理可以类似于对方法A所述的程序进行。

[0615] 制备实施例：

[0616] 实施例1

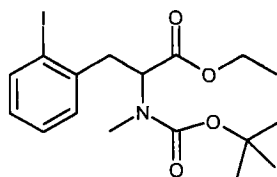
[0617] 3-苄基-6-(2-乙炔基苄基)-1,4-二甲基哌嗪-2,5-二酮

[0618]



[0619] 1. 12-(叔丁氧羰基甲基氨基)-3-(2-碘苯基)丙酸乙酯

[0620]

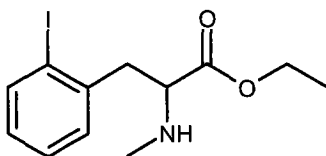


[0621] 在-78℃下将二异丙基氨基锂溶液(2M四氢呋喃/正庚烷溶液, 17ml, 34mmol)缓慢滴加到在THF(无水, 50ml)中的(叔丁氧羰基甲基氨基)乙酸乙酯(7.4g, 34mmol)中。将该混合物在该温度下搅拌2小时。然后缓慢滴加1-溴甲基-2-碘苯(10.0g, 46mmol), 将该混合物在-78℃下搅拌1小时。将该反应溶液缓慢(12小时)温热到室温, 然后在旋转蒸发器上浓缩。将残余物溶于乙酸乙酯中、洗涤、干燥并浓缩。然后通过柱层析法(SiO₂, 己烷/乙酸乙酯)提纯以此方式得到的残余物。得到6.4g(43%)目标化合物。

[0622] M+Na(m/z): 456。

[0623] 1. 2) 3-(2-碘苯基)-2-甲基氨基丙酸乙酯

[0624]

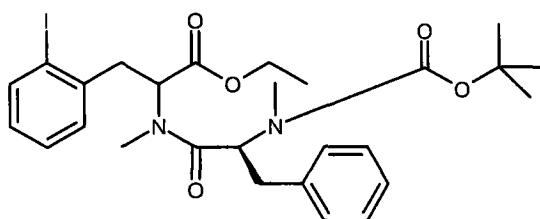


[0625] 将三氟乙酸 (25ml) 加入在 CH_2Cl_2 (35ml) 中的 2-(叔丁氧基羰基甲基氨基)-3-(2-碘苯基)丙酸乙酯 (6.4g, 15mmol) 中。并将该混合物在室温下搅拌 2 小时。将反应溶液在旋转蒸发器上浓缩, 将残留物溶解在乙酸乙酯中、洗涤 (饱和的 NaHCO_3)、干燥并浓缩。将以此方式得到的残留物 (3.9g, 79%) 以粗产物进一步反应。

[0626] $\text{M}+1 (\text{m/z})$: 334。

[0627] 1.32)-{[2-(叔丁氧基羰基甲基氨基)-3-苯基丙酰基]甲基氨基}3-(2-碘苯基)丙酸乙酯

[0628]

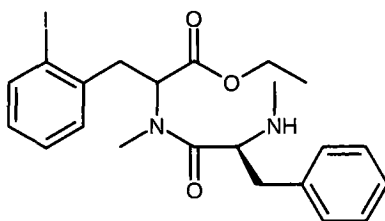


[0629] 将 3-(2-碘苯基)-2-甲基氨基丙酸乙酯 (3.94g, 12mmol)、2-(叔丁氧基羰基甲基氨基)-3-苯基丙酸 (3.7g, 13mmol)、N-乙基二异丙基胺 (7.8g, 61mmol) 和 EDAC (4.6g, 24mmol) 在 THF (无水, 50ml) 中搅拌 16 小时。将反应溶液在旋转蒸发器上浓缩。将残留物溶于乙酸乙酯中、洗涤、干燥并浓缩。通过柱层析 (SiO_2 , 己烷 / 乙酸乙酯) 提纯得到 4.0g (56%) 目标化合物。

[0630] $\text{M}+\text{Na} (\text{m/z})$: 617。

[0631] 1.4)3-(2-碘苯基)-2-[甲基-(2-甲基氨基-3-苯基丙酰基)氨基]丙酸乙酯

[0632]

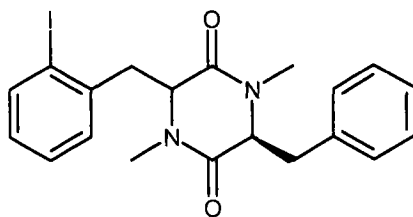


[0633] 将三氟乙酸 (10ml) 加入在 CH_2Cl_2 (10ml) 中的 2-{[2-(叔丁氧基羰基甲基氨基)-3-苯基丙酰基]甲基氨基}-3-(2-碘苯基)丙酸乙酯 (2.5g, 4.2mmol) 中。将混合物在室温下搅拌 2 小时, 然后在旋转蒸发器上浓缩。通过柱层析 (SiO_2 , 己烷 / 乙酸乙酯) 提纯残留物。

[0634] $\text{M}+1 (\text{m/z})$: 495。

[0635] 1.5)3-苄基-6-(2-碘苄基)-1,4-二甲基哌嗪-2,5-二酮

[0636]

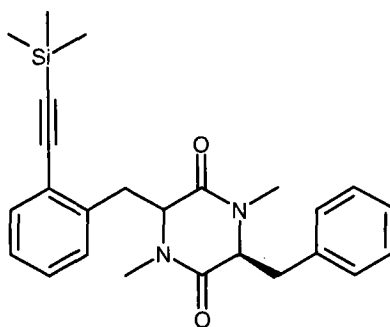


[0637] 将 3-(2-碘苯基)-2-[(1-甲基-(2-甲基氨基-3-苯基丙酰基)氨基)丙酸乙酯 (2.1g, 4.2mmol) 溶于 THF (30ml) 中, 并加入 NH_4OH (25% (w/v), 在 H_2O 中, 20ml)。将混合物在室温下搅拌 12 小时, 然后在旋转蒸发器上浓缩。以此方式得到的残留物通过柱层析 (SiO_2 , 己烷/乙酸乙酯) 提纯。这产生 0.4g (21%) 非极性异构体和 0.6g (31%) 极性异构体。

[0638] $\text{M}+1$ (m/z) : 449。

[0639] 1.6) 3-苄基-1,4-二甲基-6-(2-三甲基硅烷基乙炔基苄基)哌嗪-2,5-二酮

[0640]



[0641] 在氩气下, 将 3-苄基-6-(2-碘苄基)-1,4-二甲基哌嗪-2,5-二酮 (来自 1.5 的极性异构体, 100mg, 0.22mmol) 与二异丙基酰胺 (0.5ml)、三甲基甲硅烷基乙炔 (40mg, 0.4mmol)、 $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ (60mg, 0.05mmol) 和 CuI (10mg, 0.05mmol) 在 DMF (无水, 5ml) 中在 80°C 下一起搅拌 12 小时。在冷却并加入 H_2O 之后, 用甲基叔丁基醚萃取混合物, 将有机相干燥并浓缩。通过柱层析提纯以无色油得到 21mg (23%) 目标化合物。

[0642] $\text{M}+1$ (m/z) : 419。

[0643] 1.7) 3-苄基-6-(2-乙炔基苄基)-1,4-二甲基哌嗪-2,5-二酮

[0644] 在 0°C 下, 将四丁基氟化铵 (1mM, 在 THF 中, 0.5ml, 0.5mmol) 滴加入在 THF (无水, 5ml) 中的 3-苄基-1,4-二甲基-6-(2-三甲基硅烷基乙炔基苄基)哌嗪-2,5-二酮 (140mg, 0.22mmol)。将混合物在该温度下搅拌 1 小时。在加入 NH_4Cl (饱和, 水性) 溶液之后, 用乙酸乙酯萃取混合物, 将有机相干燥并浓缩。通过柱层析提纯以黄色油得到 50mg (65%) 目标化合物。

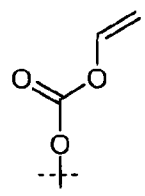
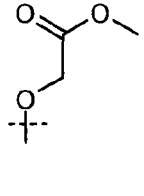
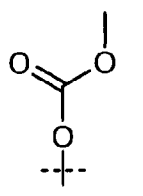
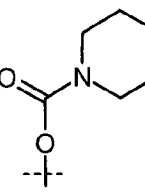
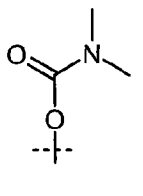
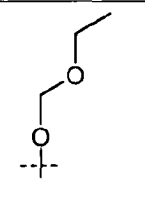
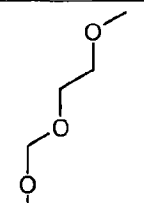
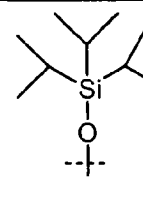
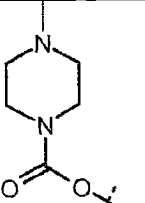
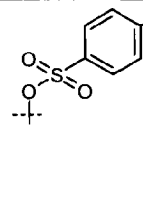
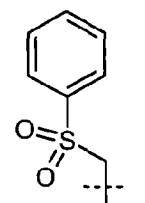
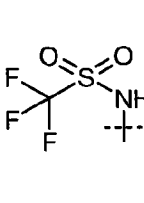
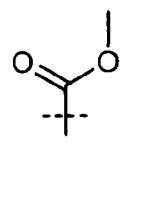
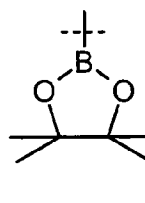
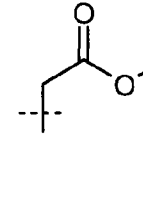
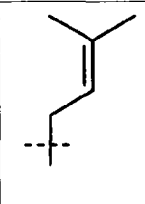
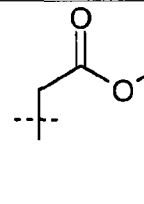
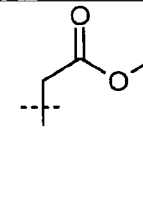
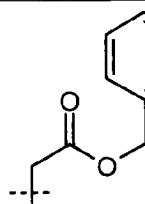
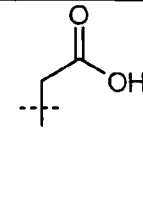
[0645] $\text{M}+1$ (m/z) : 346。

[0646] $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) : δ = 2.41 (d, 2H), 2.72 (s, 3H), 2.87 (s, 3H), 3.00 (dm, 1H), 3.12 (dm, 1H), 3.31 (s, 1H), 4.16 (m, 2H), 6.94 (dm, 1H), 7.14-7.31 (brm, 5H), 7.35 (m, 2H), 7.45 (m, 1H)。

[0647] 式 I 的其它化合物以类似的方式制备, 其中下述表 II 的结构单元用作下表 A.1-A.4 的图例。

[0648] 表 II

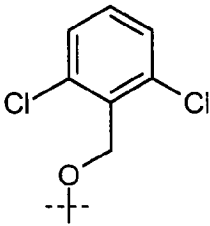
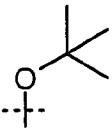
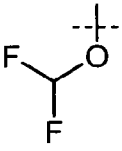
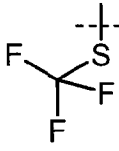
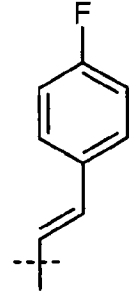
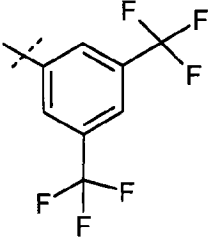
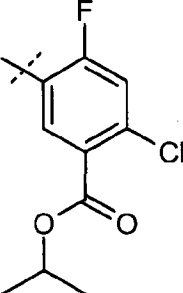
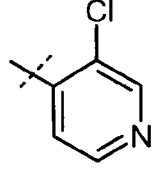
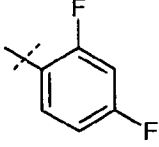
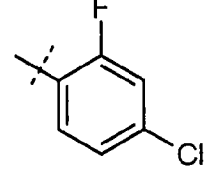
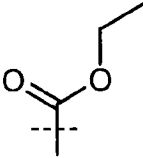
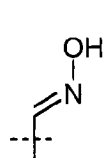
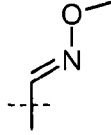
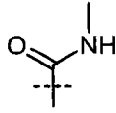
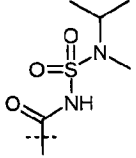
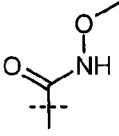
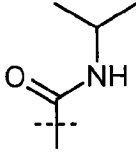
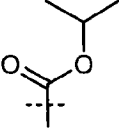
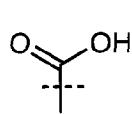
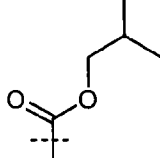
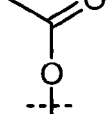
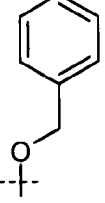
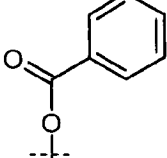
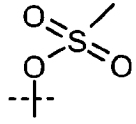
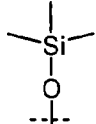
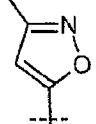
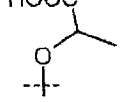
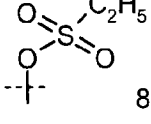
[0649]

 1)	 2)	 3)	 4)	 5)
 6)	 7)	 8)	 9)	 10)
 11)	 12)	 13)	 14)	 15)
 16)	 17)	 18)	 19)	 20)

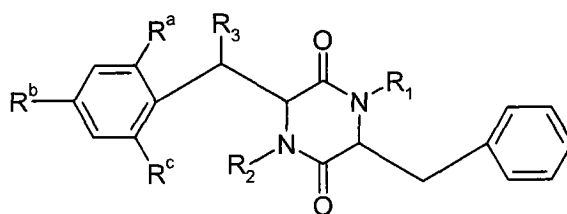
[0650]

 21)	 22)	 23)	 24)	 25)
 26)	 27)	 28)	 29)	 30)
 31)	 32)	 33)	 34)	 35)
 36)	 37)	 38)	 39)	 40)
 41)	 42)	 43)	 44)	 45)
 46)	 47)	 48)	 49)	 50)

[0651]

				
51)	52)	53)	54)	55)
				
56)	57)	58)	59)	60)
				
61)	62)	63)	64)	65)
				
66)	67)	68)	69)	70)
				
71)	72)	73)	74)	75)
				
76)	77)	78)	79)	80)

[0652]



A.1

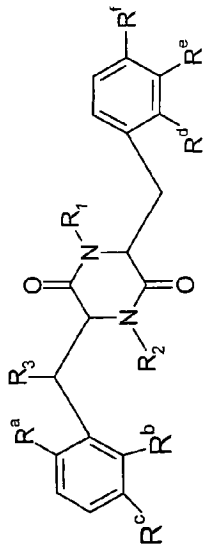
[0653] 表 A. 1

[0654]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	RT HPLC/MS 或熔点	非对映 体
A. 1. 1	NO ₂	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	3.187min m/z = 435.9[M+H] ⁺	非对映 体 2
A. 1. 2	NO ₂	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	3.079min m/z = 435.9[M+H] ⁺	非对映 体 1
A. 1. 3	F	F	H	CH ₃	CH ₃	H	2.702min m/z = 359.1[M+H] ⁺	非对映 体 1
A. 1. 4	Cl	F	H	CH ₃	CH ₃	H	2.962min m/z = 375.3[M+H] ⁺	非对映 体 1
A. 1. 5	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	2.737min m/z = 377.2[M+H] ⁺	非对映 体 1
A. 1. 6	F	F	H	CH ₃	CH ₃	H	2.808min m/z = 359.1[M+H] ⁺	非对映 体 2
A. 1. 7	Cl	F	H	CH ₃	CH ₃	H	3.042min m/z = 375.4[M+H] ⁺	非对映 体 2
A. 1. 8	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	2.950min m/z = 377.1[M+H] ⁺	非对映 体 2

A. 1. 9	NO ₂	F	H	CH ₃	CH ₃	H	2. 808min m/z = 386. 0[M+H] ⁺	非对映 体 2
A. 1. 10	NO ₂	Cl	H	CH ₃	CH ₃	H	3. 068min m/z = 402. 0[M+H] ⁺	非对映 体 2
A. 1. 11	NO ₂	F	H	CH ₃	CH ₃	H	2. 716min m/z = 386. 0[M+H] ⁺	非对映 体 1
A. 1. 12	NO ₂	Cl	H	CH ₃	CH ₃	H	2. 938min m/z = 402. 0[M+H] ⁺	非对映 体 1
A. 1. 13	NO ₂	79)	H	CH ₃	CH ₃	H	2. 324min m/z = 455 [M ⁺]	

[0655]



(A.2)

表 A.2

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	或非 映体
A.2.1	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	1)	H	H	H	65°C	
A.2.2	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	2)	H	H	H	130°C	
A.2.3	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	3)	H	H	H	74°C	
A.2.4	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	4)	H	H	H	207°C	
A.2.5	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	5)	H	H	H	176°C	
A.2.6	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	6)	H	H	H	117°C	
A.2.7	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	7)	H	H	H	m/z=472.1 [M+H] ⁺	
A.2.8	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	8)	H	H	H	155°C	
A.2.9	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	9)	H	H	H	207°C	
A.2.10	NO ₂	H	H	NH ₂	CH ₃	H	H	H	H	2.483min m/z=369.2 [M+H] ⁺ , 177°C	非对映 体 1

[0656]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	非 对 映体
A.2.11	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	1)	H	H	H	120°C	
A.2.12	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	3)	H	H	H	124°C	
A.2.13	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	4)	H	H	H	184°C	
A.2.14	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	5)	H	H	H	118°C	
A.2.15	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	5)	H	H	H	68°C	
A.2.16	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	4)	H	H	H	162°C	
A.2.17	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	3)	H	H	H	140°C	
A.2.18	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	1)	H	H	H	139°C	
A.2.19	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	5)	H	H	H	68°C	
A.2.20	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	4)	H	H	H	162°C	
A.2.21	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	1)	H	H	H	129°C	
A.2.22	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	10)	H	H	H	3.378min m/z=538.0 [M+H] ⁺	非 对 映体 2
A.2.23	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	10)	H	H	H	3.352min m/z=538.0 [M+H] ⁺	非 对 映体 1
A.2.24	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	10)	H	H	H	3.354min m/z=538.0 [M+H] ⁺	非 对 映体 3
A.2.25	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	2.579min m/z=354.0 [M+H] ⁺	非 对 映体 1
A.2.26	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	2.651min m/z=354.0 [M+H] ⁺	非 对 映体 2
A.2.27	F	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.867min	

[0657]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 或 熔点	非 对 映体
										m/z=341.1 [M+H] ⁺	
A.2.28	Cl	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.134min m/z=357.2 [M+H] ⁺	
A.2.29	Ph	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.400min m/z=399.1 [M+H] ⁺	非 对 映体 1
A.2.30	11)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.873min m/z=477.1 [M+H] ⁺	非 对 映体 2
A.2.31	Ph	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.416min m/z=399.1 [M+H] ⁺	非 对 映体 2
A.2.32	11)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.823min m/z=477.1 [M+H] ⁺	非 对 映体 1
A.2.33	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.536min m/z=368.0 [M+H] ⁺	非 对 映体 1
A.2.34	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.640min m/z=368.0 [M+H] ⁺	非 对 映体 2
A.2.35	NO ₂	F	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.733min m/z=386.1 [M+H] ⁺	非 对 映体 2
A.2.36	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	F	H	H	2.496min m/z=371.9 [M+H] ⁺	非 对 映体 2
A.2.37	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	F	H	H	2.688min m/z=386.0 [M+H] ⁺	
A.2.38	NH ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.026min m/z=338.0 [M+H] ⁺	

[0658]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 或 熔点	非 对 映体
A.2.39	F	H	H	H	CH ₃	H	CF ₃	H	H	2.872min m/z=394.9 [M+H] ⁺	非 对 映体 1
A.2.40	12)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.186min m/z=469.9 [M+H] ⁺	
A.2.41	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	NO ₂	H	H	2.479min m/z=398.9 [M+H] ⁺	非 对 映体 2
A.2.42	F	H	H	CH ₃	CH ₃	H	CF ₃	H	H	3.160min m/z=409.4 [M+H] ⁺	
A.2.43	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	F	H	2.561min m/z=371.9 [M+H] ⁺	非 对 映体 2
A.2.44	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	F	H	2.729min m/z=385.9 [M+H] ⁺	
A.2.45	NO ₂	F	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.624min m/z=386.1 [M+Na] ⁺	非 对 映体 1
A.2.46	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	F	H	H	2.468min m/z=371.9 [M+H] ⁺	非 对 映体 1
A.2.47	NO ₂	H	CH ₃ O-	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.571min m/z=428.0 [M+H] ⁺	非 对 映体 1
A.2.48	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	F	H	H	2.694min m/z=385.9 [M+H] ⁺	

[0659]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	非对映 体
A.2.49	F	H	H	H	CH ₃	H	CF ₃	H	H	2.921min m/z=394.9 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.50	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	NO ₂	H	H	2.464min m/z=398.9 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.51	F	H	H	CH ₃	CH ₃	H	CF ₃	H	H	3.071min m/z=408.9 [M+H] ⁺	
A.2.52	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	F	H	2.509min m/z=371.9 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.53	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	F	H	2.630min m/z=385.9 [M+H] ⁺	
A.2.54	13)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.547min m/z=381.0 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.55	13)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.769min m/z=381.0 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.56	14)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	m/z=449.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.57	NO ₂	H	H	PhCH ₂ -	CH ₃	H	H	H	H	3.398min m/z=444.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.58	NO ₂	H	H	15)	CH ₃	H	H	H	H	2.932min m/z=426.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.59	NO ₂	H	H	16)	CH ₃	H	H	H	H	3.361min m/z=422.2 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.60	NO ₂	H	H	17)	CH ₃	H	H	H	H	3.337min	非对映

[0660]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 或 熔点	非对映 体
										m/z=454.1 [M+H] ⁺	体 2
A.2.61	14)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	m/z=448.9 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.62	NO ₂	H	H	PhCH ₂ -	CH ₃	H	H	H	H	3.459min m/z=444.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.63	NO ₂	H	H	15)	CH ₃	H	H	H	H	2.928min m/z=426.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.64	NO ₂	H	H	16)	CH ₃	H	H	H	H	3.420min m/z=422.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.65	NO ₂	H	H	17)	CH ₃	H	H	H	H	3.285min m/z=454.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.66	NO ₂	H	H	18)	CH ₃	H	H	H	H	3.528min m/z=490.1[M+Na] ⁺	非对映 体 2
A.2.67	NO ₂	H	H	18)	CH ₃	H	H	H	H	3.458min m/z=490.1[M+Na] ⁺	非对映 体 1
A.2.68	NO ₂	H	H	19)	CH ₃	H	H	H	H	3.578min m/z=502.5 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.69	NO ₂	H	H	20)	CH ₃	H	H	H	H	2.634min m/z=412.1 [M+H] ⁺	
A.2.70	NO ₂	H	H	19)	CH ₃	H	H	H	H	3.547min m/z=502.5 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.71	NO ₂	H	H	20)	CH ₃	H	H	H	H	2.634min m/z=412.1 [M+H] ⁺	

[0661]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	或 非对映 体
A.2.72	NO ₂	H	H	21)	CH ₃	H	H	H	H	3.844min m/z=526.5 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.73	NO ₂	H	H	22)	CH ₃	H	H	H	H	3.516min m/z=458.4 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.74	NH ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	1.801min m/z=338.2 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.75	NO ₂	H	H	22)	CH ₃	H	H	H	H	3.511min m/z=458.4 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.76	NO ₂	H	H	21)	CH ₃	H	H	H	H	3.844min m/z=526.5 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.77	NO ₂	H	H	23)	CH ₃	H	H	H	H	3.252min m/z=449.1 [M+H] ⁺	
A.2.78	NO ₂	H	H	24)	CH ₃	H	H	H	H	3.411min m/z=480.4 [M+H] ⁺	
A.2.79	NO ₂	H	H	25)	CH ₃	H	H	H	H	3.022min m/z=449.1 [M+H] ⁺ , 137°C	非对映 体 1
A.2.80	NO ₂	H	H	25)	CH ₃	H	H	H	H	3.076min m/z=449.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.81	CN	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	m/z=348.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.82	CN	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	m/z=348.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2

[0662]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 或 熔点	非对映 体
A.2.83	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	Br	H	H	m/z=433.8 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.84	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	Br	H	m/z=433.8 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.85	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	Br	H	H	m/z=433.8 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.86	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	Br	H	m/z=433.8 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.87	26) NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.749min m/z=459.1 [M+H] ⁺	
A.2.88	NO ₂	H	H	13)	CH ₃	H	H	H	H	2.969min m/z=412.1 [M+H] ⁺	
A.2.89	NO ₂	H	H	HO-CH ₂ _	CH ₃	H	H	H	H	2.565min m/z=384.1 [M+H] ⁺	
A.2.90	NO ₂	H	H	27)	CH ₃	H	H	H	H	3.419min m/z=501.1 [M+H] ⁺ , 164°C	
A.2.91	NO ₂	H	H	28)	CH ₃	H	H	H	H	3.011min m/z=473.1 [M+H] ⁺	
A.2.92	NO ₂	H	H	29)	CH ₃	H	H	H	H	3.562min m/z=454.1 [M+H] ⁺	
A.2.93	NO ₂	H	H	30)	CH ₃	H	H	H	H	3.115min m/z=396.1 [M+H] ⁺	
A.2.94	NO ₂	H	H	31)	CH ₃	H	H	H	H	3.728min m/z=525.2 [M+H] ⁺	

[0663]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT 熔点 HPLC/MS 或非对映体
A.2.95	NO ₂	H	H	13)	CH ₃	H	H	H	H	2.998min m/z=412.1 [M+H] ⁺
A.2.96	NO ₂	H	H	HO-CH ₂	CH ₃	H	H	H	H	2.637min m/z=384.4 [M+H] ⁺
A.2.97	I	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.101min m/z=449.0 [M+H] ⁺
A.2.98	B(OH) ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.260min m/z=367.1 [M+H] ⁺
A.2.99	NH ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.188min m/z=380.1 [M+H] ⁺ , 161°C
A.2.100	32)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.251min m/z=380.1 [M+H] ⁺ , 145°C
A.2.101	33)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.876min m/z=442.1 [M+H] ⁺ , 186°C
A.2.102	34)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.838min m/z=448.1 [M+H] ⁺ , 99°C
A.2.103	35)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.549min m/z=406.1 [M+H] ⁺
A.2.104	36)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.662min m/z=494.0 [M+H] ⁺
A.2.105	37)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.431min m/z=416.1 [M+H] ⁺

[0664]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	非对映 体
A.2.106	38)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.781min m/z=464.1 [M+H] ⁺	
A.2.107	39)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.053min m/z=457.1 [M+H] ⁺ , 182°C	
A.2.108	40)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.573min m/z=396.1 [M+H] ⁺	
A.2.109	41)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.227min m/z=438.2 [M+H] ⁺	
A.2.110	42)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.310min m/z=409.2 [M+H] ⁺	
A.2.111	43)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.842min m/z=459.1 [M+H] ⁺	
A.2.112	44)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.988min m/z=535.1 [M+H] ⁺	
A.2.113	45)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.070min m/z=478.0 [M+H] ⁺ , 227°C	
A.2.114	46)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.297min m/z=438.2 [M+H] ⁺	
A.2.115	NO ₂	H	H	N C-	CH ₃	H	H	H	H	3.079min m/z=401.0 [M+H] ⁺	
A.2.116	NO ₂	H	H	N C-C H ₂ -	CH ₃	H	H	H	H	2.876min m/z=393.1 [M+H] ⁺	
A.2.117	NO ₂	H	H	23)	CH ₃	H	H	H	H	3.290min m/z=449.2 [M+H] ⁺	
A.2.118	NO ₂	H	H	24)	CH ₃	H	H	H	H	3.373min	

[0665]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	非对映 体
										m/z=480.0 [M+H] ⁺	
A.2.119	HO-	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.460min m/z=339.1 [M+H] ⁺	
A.2.120	47)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.207min m/z=497.1 [M+H] ⁺	
A.2.121	48)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.975min m/z=425.2 [M+H] ⁺	
A.2.122	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	Br	H	H	2.979min m/z=448.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.123	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	Br	H	3.055min m/z=448.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.124	73)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.629min m/z=381.0 [M+H] ⁺	
A.2.125	HO-	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.330min m/z=339.1 [M+H] ⁺	
A.2.126	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	Br	H	H	2.984min m/z=448.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.127	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	Br	H	2.989min m/z=448.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.128	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	49)	49)	H	2.994min m/z=404.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.129	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	CN	H	2.417min m/z=379.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.130	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	NO ₂	H	2.541min	非对映

[0666]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	非对映 体
										m/z=399.1 [M+H] ⁺	体 1
A.2.131	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	H	2.543min m/z=399.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.132	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	26)	H	H	2.779min m/z=504.1 [M+H] ⁺	
A.2.133	NO ₂	Br	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.034min m/z=446.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.134	50)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.886min m/z=419.2 [M+H] ⁺	
A.2.135	HC≡C-	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.860min m/z=347.0 [M+H] ⁺	
A.2.136	NO ₂	Br	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.901min m/z=445.9 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.137	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	49)	49)	H	2.934min m/z=404.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.138	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	CN	H	2.435min m/z=379.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.139	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	NO ₂	H	2.569min m/z=399.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.140	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	NO ₂	2.549min m/z=399.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.141	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	51)	3.473min m/z=527.9 [M+H] ⁺	非对映 体 2

[0667]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 或 熔点	非对映 体
A.2.142	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	I	2.951min m/z=479.8 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.143	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	F	2.553min m/z=372.0 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.144	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	52)	2.027min m/z=370.0 [M+H] ⁺ 叔丁基	非对映 体 2
A.2.145	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	CH ₃	H	2.698min m/z=368.0 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.146	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	Cl	H	H	2.758min m/z=388.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.147	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	49)	49)	2.969min m/z=404.2 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.148	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	Cl	2.812min m/z=388.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.149	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	CH ₃	2.734min m/z=368.2 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.150	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	I	H	H	2.736min m/z=368.2 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.151	53)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.866min m/z=389.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.152	Cl	H	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.168min m/z=391.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1

[0668]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	非对映 体
A.2.153	Cl	Cl	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.129min m/z=391.4 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.154	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.308min m/z=425.0 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.155	F	H	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.933min m/z=375.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.156	Br	H	F	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.038min m/z=421.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.157	F	Cl	F	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.965min m/z=393.3 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.158	55)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.324min m/z=423.2 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.159	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.859min m/z=373.2 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.160	F	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.116min m/z=409.2 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.161	F	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.137min m/z=389.4 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.162	F	F	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.625min m/z=359.2 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.163	F	Cl	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.959min m/z=375.3 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.164	I	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.046min	非对映

[0669]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	非对映 体
										m/z=448.9 [M+H] ⁺	体 1
A.2.165	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	51)	3.366min m/z=527.9 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.166	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	I	2.929min m/z=479.8 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.167	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	F	2.585min m/z=372.0 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.168	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	52)	2.013min m/z=370.0 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.169	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	CH ₃	H	2.724min m/z=368.0 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.170	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	Cl	H	H	2.707min m/z=388.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.171	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	49)	49)	2.941min m/z=404.2 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.172	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	Cl	2.823min m/z=388.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.173	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	H	CH ₃	2.759min m/z=368.2 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.174	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	I	H	H	2.720min m/z=368.2 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.175	53)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.931min m/z=389.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2

[0670]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	非对映 体
A.2.176	F	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.808min m/z=359.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.177	Cl	H	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.251min m/z=391.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.178	Cl	Cl	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.189min m/z=391.4 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.179	Cl	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.376min m/z=424.9 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.180	F	H	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.068min m/z=375.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.181	Br	H	F	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.089min m/z=421.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.182	F	Cl	F	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.062min m/z=393.3 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.183	55)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.327min m/z=432.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.184	F	F	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.056min m/z=373.2 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.185	F	H	CF ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.226min m/z=409.2 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.186	F	Cl	CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.240min m/z=389.4 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.187	F	F	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.832min	非对映

[0671]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	或非 映体
										m/z=359.2 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.188	F	Cl	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.042min m/z=375.4 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.189	I	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.071min m/z=448.9 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.190	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	CF ₃	H	H	2.814min m/z=422.4 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.191	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	CF ₃	H	H	2.956min m/z=422.3 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.192	56)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.625min m/z=465.0 [M+Na] ⁺	
A.2.193	PO(O H) ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	1.942min m/z=403.0 [M+H] ⁺	
A.2.194	56)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.665min m/z=443.0 [M+H] ⁺	
A.2.195	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	CN	H	H	2.475min m/z=379.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.196	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	CN	H	H	2.346min m/z=379.0 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.197	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	57)	H	H	3.709min m/z=566.2 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.198	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	58)	H	H	3.597min m/z=568.2 [M+H] ⁺	非对映

[0672]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 或 熔点	非对映 体
A.2.199	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	59)	H	H	126°C	体 1
A.2.200	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	60)	H	H	3.145min m/z=466.2 [M+H] ⁺	
A.2.201	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	60)	H	3.215min m/z=466.0 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.202	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	57)	H	3.793min m/z=566.2 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.203	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	61)	H	2.433min m/z=481.9 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.204	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	58)	H	3.692min m/z=590.2 [M+Na] ⁺	非对映 体 1
A.2.205	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	59)	H	2.503min m/z=465.2 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.206	59)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.883min m/z=434.1 [M+H] ⁺	
A.2.207	61)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.499min m/z=451.2 [M+H] ⁺	
A.2.208	58)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.813min m/z=537.2 [M+H] ⁺	
A.2.209	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	57)	H	H	3.777min m/z=565.9 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.210	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	60)	H	H	121°C	

[0673]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	或 熔点	非对映 体
A.2.211	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	60)	H	3.229min m/z=466.0 [M+H] ⁺		非对映 体 2
A.2.212	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	57)	H	3.853min m/z=566.2 [M+H] ⁺		非对映 体 2
A.2.213	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	61)	H	2.485min m/z=482.2 [M+H] ⁺		非对映 体 2
A.2.214	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	58)	H	3.697min m/z=590.1 [M+Na] ⁺		非对映 体 2
A.2.215	NO ₂	H	H	H	CH ₃	H	H	59)	H	2.406min m/z=465.2 [M+H] ⁺		非对映 体 1
A.2.216	60)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.352min m/z=435.2 [M+H] ⁺		非对映 体 2
A.2.217	61)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.576min m/z=451.2 [M+H] ⁺		非对映 体 2
A.2.218	58)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.864min m/z=537.2 [M+H] ⁺		非对映 体 2
A.2.219	62)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.695min m/z=403.1 [M+H] ⁺		
A.2.220	I	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.014min m/z=448.9 [M+H] ⁺		非对映 体 1
A.2.221	I	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.041min m/z=448.9 [M+H] ⁺		非对映 体 2

[0674]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	非对映 体
A.2.222	NO ₂	H	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.035min m/z=402.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.223	63)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.009min m/z=395.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.224	NO ₂	H ₂ C=C H-	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.981min m/z=394.0 [M+H] ⁺	
A.2.225	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	CN	H	H	2.592min m/z=393.2 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.226	NO ₂	H	Cl	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.919min m/z=402.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.227	63)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.864min m/z=395.2 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.228	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	CN	H	H	2.525min m/z=393.2 [M+H] ⁺ , 184°C	非对映 体 1
A.2.229	NO ₂	H	H	H ₂ N-	CH ₃	H	H	H	H	2.599min m/z=369.2 [M+H] ⁺ , 115°C	非对映 体 2
A.2.230	NO ₂	Cl	63)	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.095min m/z=474.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.231	NO ₂	Cl	13)	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.882min m/z=460.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.232	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	C(O)N H ₂	H	H	2.051min m/z=411.0 [M+H] ⁺	

[0675]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	非对映 体
A.2.233	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	COOH	H	H	2.401min m/z=412.0 [M+H] ⁺	
A.2.234	NO ₂	Cl	63)	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.172min m/z=474.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.235	NO ₂	Cl	13)	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.970min m/z=460.0 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.236	C(O) H	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.317min m/z=351.0 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.237	64)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.184min m/z=366.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.238	65)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.774min m/z=380.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.239	C(O) H	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.564min m/z=351.2 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.240	64)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.473min m/z=366.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.241	65)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.943min m/z=380.1 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.242	66)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	1.828min m/z=336.0 1.920min m/z=336.0 [M+H] ⁺	
A.2.243	67)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.864min m/z=501.0 [M+H] ⁺	

[0676]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	或非对映 体
A.2.244	68)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.152min m/z=396.0 [M+H] ⁺	
A.2.245	69)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.512min m/z=408.0 [M+H] ⁺	
A.2.246	70)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.307min m/z=409.5 [M+H] ⁺	
A.2.247	71)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.402min m/z=367.0 [M+H] ⁺	
A.2.248	72)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	3.528min m/z=423.1 [M+H] ⁺	
A.2.249	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	73)	H	H	H	2.778min m/z=426.1 [M+H] ⁺	
A.2.250	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	73)	H	H	H	2.828min m/z=426.4 [M+H] ⁺	
A.2.251	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	73)	H	H	H	2.851min m/z=426.4 [M+H] ⁺	
A.2.252	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	73)	H	H	H	2.827min m/z=426.4 [M+H] ⁺	
A.2.253	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	74)	H	H	H	3.426min m/z=474.2 [M+H] ⁺	
A.2.254	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	74)	H	H	H	3.481min m/z=474.5 [M+H] ⁺	
A.2.255	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	74)	H	H	H	3.483min m/z=474.5 [M+H] ⁺	
A.2.256	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	74)	H	H	H	3.479min m/z=474.5 [M+H] ⁺	

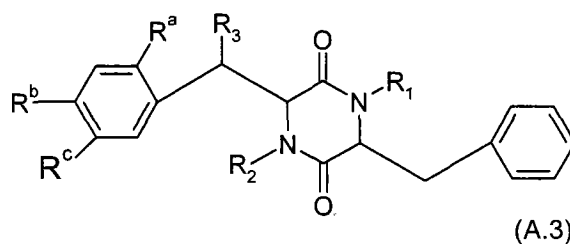
[0677]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	非对映 体
A.2.257	75)	NO ₂	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	181°C	
A.2.258	75)	NO ₂	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	73°C	
A.2.259	75)	NO ₂	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	108°C	
A.2.260	75)	NO ₂	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	108°C	
A.2.261	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	HO-	H	H	H	2.548min m/z=384.4 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.262	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	HO-	H	H	H	2.483min m/z=384.4 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.263	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	HO-	H	H	H	2.548min m/z=384.4 [M+H] ⁺	非对映 体 3
A.2.264	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	HO-	H	H	H	2.484min m/z=384.4 [M+H] ⁺	非对映 体 4
A.2.265	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	76)	H	H	H	2.687min m/z=462.0 [M+H] ⁺	非对映 体 3
A.2.266	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	76)	H	H	H	2.700min m/z=461.9 [M+H] ⁺	非对映 体 4
A.2.267	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	76)	H	H	H	2.740min m/z=462.1 [M+H] ⁺	非对映 体 1
A.2.268	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	76)	H	H	H	2.754min m/z=462.2 [M+H] ⁺	非对映 体 2
A.2.269	NO ₂	H	H	H	CH ₃	76)	H	H	H	2.475min m/z=447.9 2.593min	

[0678]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	R ^d	R ^e	R ^f	RT HPLC/MS 熔点	非对映 体
										m/z=447.9 [M+H] ⁺	
A.2.270	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	77)	H	H	H	109°C	非对映 体 1
A.2.271	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	77)	H	H	H	109°C	非对映 体 2
A.2.272	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	77)	H	H	H	144°C	非对映 体 3
A.2.273	78)	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	m/z=404.05 [M] ⁺	
A.2.274	CH=CH ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	H	H	H	H	2.980 m/z=349.1 [M+H] ⁺	
A.2.275	NO ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	80)	H	H	H	145°C	
A.2.276	Br	F	F	CH ₃	CH ₃	76)	H	H	H	3.030 m/z=531.0 [M] ⁺	

[0679]

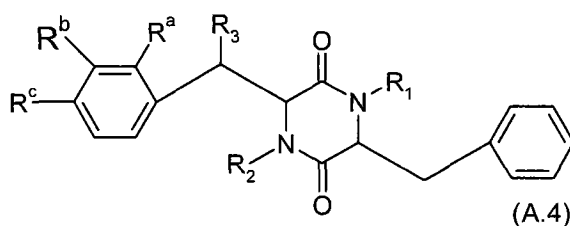


[0680] 表 A. 3

[0681]

序号	R^a	R^b	R^c	R^1	R^2	R^3	RT HPLC/MS 或熔点	非对映体
A. 3. 1	NO_2	$\text{CH}_3\text{O}-$	$\text{CH}_3\text{O}-$	CH_3	CH_3	H	2.668min $m/z = 428.0$ $[\text{M}+\text{H}]^+$	非对映体 2
A. 3. 2	NO_2	$\text{CH}_3\text{O}-$	$\text{CH}_3\text{O}-$	CH_3	CH_3	H	2.571min $m/z = 428.0$ $[\text{M}+\text{H}]^+$	非对映体 1

[0682]



[0683] 表 A. 4

[0684]

序号	R^a	R^b	R^c	R^1	R^2	R^3	RT HPLC/MS 或熔点	非对映 体
A. 4. 1	Cl	CH_3	$\text{H}_3\text{CS}-$	CH_3	CH_3	H	3.354min $m/z = 417.0[\text{M}+\text{H}]^+$	非对映 体 1
A. 4. 2	Cl	CH_3	$\text{H}_3\text{CS}-$	CH_3	CH_3	H	3.397min $m/z = 417.0[\text{M}+\text{H}]^+$	非对映 体 2
A. 4. 3	Cl	54)	H	CH_3	CH_3	H	3.513min $m/z = 399.2[\text{M}+\text{H}]^+$	非对映 体 1

A. 4. 4	Cl	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	3. 281min m/z = 425. 4[M+H] ⁺	
A. 4. 5	Cl	CH ₃	H ₃ CS-	CH ₃	CH ₃	H	3. 389min m/z = 417. 2[M+H] ⁺	非对映 体 1
A. 4. 6	F	Cl	H	CH ₃	CH ₃	H	2. 927min m/z = 375. 4[M+H] ⁺	非对映 体 1
A. 4. 7	F	F	H	CH ₃	CH ₃	H	2. 739min m/z = 359. 4[M+H] ⁺	非对映 体 1
A. 4. 8	F	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	3. 096min m/z = 409. 2[M+H] ⁺	非对映 体 1

[0685]

序号	R ^a	R ^b	R ^c	R ¹	R ²	R ³	RT HPLC/MS 或熔点	非对映 体
A. 4. 9	Cl	Cl	H ₃ CO-	CH ₃	CH ₃	H	3. 088min m/z = 421. 4[M+H] ⁺	非对映 体 1
A. 4. 10	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	2. 872min m/z = 377. 2[M+H] ⁺	非对映 体 1
A. 4. 11	Cl	54)	H	CH ₃	CH ₃	H	3. 557min m/z = 399. 2[M+H] ⁺	非对映 体 2
A. 4. 12	Cl	CH ₃	H ₃ CS-	CH ₃	CH ₃	H	3. 428min m/z = 417. 1[M+H] ⁺	非对映 体 2
A. 4. 13	F	Cl	H	CH ₃	CH ₃	H	3. 052min m/z = 375. 3[M+H] ⁺	非对映 体 2

A. 4. 14	F	F	H	CH ₃	CH ₃	H	2. 965min $m/z = 359. 4 [M+H]^+$	非对映 体 2
A. 4. 15	F	CF ₃	H	CH ₃	CH ₃	H	3. 209min $m/z = 409. 2 [M+H]^+$	非对映 体 2
A. 4. 16	Cl	Cl	H ₃ CO-	CH ₃	CH ₃	H	3. 102min $m/z = 421. 1 [M+H]^+$	非对映 体 2
A. 4. 17	F	F	F	CH ₃	CH ₃	H	2. 999min $m/z = 377. 1 [M+H]^+$	非对映 体 2
A. 4. 18	Cl	Cl	H ₃ CO-	CH ₃	CH ₃	H	3. 138min $m/z = 421. 3 [M+H]^+$	
A. 4. 19	NO ₂	13)	H	CH ₃	CH ₃	H	2. 764min $m/z = 426. 0 [M+H]^+$	非对映 体 2
A. 4. 20	NO ₂	13)	H	CH ₃	CH ₃	H	2. 754min $m/z = 426. 0 [M+H]^+$	非对映 体 1

[0686] 列于下表 A. 5 的其它式 I 化合物以类似方式制备。

[0687] 表 A. 5

[0688]

序号	名称	RT HPLC/MS 或熔点	非对映 体
A. 5. 1	1- 甲基 -6-(2- 硝基苄基)-3- 噻吩 -2- 基甲基哌嗪 -2,5- 二酮	2. 474min $m/z = 360. 3 [M+H]^+$	非对映 体 1
A. 5. 2	1,4- 二甲基 -3-(2- 硝基苄基)-6- 噻吩 -2- 基甲基哌嗪 -2,5- 二酮	2. 564min $m/z = 373. 9 [M+H]^+$	非对映 体 1
A. 5. 3	1- 甲基 -6-(2- 硝基苄基)-3- 噻吩 -2- 基甲基哌嗪 -2,5- 二酮	2. 374min $m/z = 360. 3 [M+H]^+$	非对映 体 2

[0689]

序号	名称	RT HPLC/MS 或熔点	非对映 体
A. 5. 4	1,4-二甲基-3-(2-硝基苄基)-6-噻吩-2-基甲基哌嗪-2,5-二酮	2.418min $m/z = 373.9[M+H]^+$	非对映 体 2
A. 5. 5	1,4-二甲基-3,6-二-(2-硝基苄基)-哌嗪-2,5-二酮	2.666min $m/z = 412.9[M+H]^+$	
A. 5. 6	3-苄基-1,4-二甲基-6-(2-硝基苄基)-哌嗪-2,5-二酮	2.868min $m/z = 382.1$ 3.192min $m/z = 382.1[M+H]^+$	
A. 5. 7	1-甲基-6-(2-硝基苄基)-3-四唑-2-基甲基哌嗪-2,5-二酮	1.753min $m/z = 346.1[M+H]^+$	非对映 体 1
A. 5. 8	1-甲基-6-(2-硝基苄基)-3-四唑-2-基甲基哌嗪-2,5-二酮	1.829min $m/z = 346.1[M+H]^+$	非对映 体 2
A. 5. 9	1-甲基-6-(2-硝基苄基)-3-[1,2,4]三唑-1-基甲基哌嗪-2,5-二酮	1.669min $m/z = 345.1[M+H]^+$	非对映 体 1
A. 5. 10	N-{2-[2-(5-苄基-1,4-二甲基-3,6-二氧化代-哌嗪-2-基)-乙酰基]-3-硝基苄基}-甲酰胺	2.504min $m/z = 461.1[M+Na]^+$	
A. 5. 11	1-甲基-6-(2-硝基苄基)-3-[1,2,4]三唑-1-基甲基哌嗪-2,5-二酮	1.671min $m/z = 345.1[M+H]^+$	非对映 体 2
A. 5. 12	3-苄基-1,3-二甲基-6-(2-硝基苄基)-哌嗪-2,5-二酮	2.652min $m/z = 368.0[M+H]^+$	非对映 体 1
A. 5. 13	3-苄基-1,3-二甲基-6-(2-硝基苄基)-哌嗪-2,5-二酮	2.696min $m/z = 368.0[M+H]^+$	非对映 体 2
A. 5. 14	1-甲基-6-(2-硝基苄基)-3-吡啶-3-基甲基哌嗪-2,5-二酮	1.555min $m/z = 355.0[M+H]^+$	非对映 体 1
A. 5. 15	1-甲基-6-(2-硝基苄基)-3-吡啶-3-基甲基哌嗪-2,5-二酮	1.580min $m/z = 355.0[M+H]^+$	非对映 体 2

A. 5. 16	(5- 苄基 -1,4- 二甲基 -3,6- 二氧代哌嗪 -2- 基)-(2- 溴吡啶 -3- 基) 甲烷磺酸甲酯	2. 530min m/z = 498[M+H] ⁺	
A. 5. 17	[1,4- 二甲基 -3,6- 二氧代 -5-(噻吩 -2- 基甲基) 哌嗪 -2- 基]-(2- 硝基苯基) 甲烷磺酸甲酯	2. 575min m/z = 468. 1[M+H] ⁺	

[0690] 产物通过 HPLC/MS (与质谱法联用的高效液相色谱法)、NMR 或其熔点表征。

[0691] HPLC 柱 :RP-18 柱 (德国 Merck KgaA 的 Chromolith Speed ROD) 洗脱液 :乙腈 +0.1% 三氟乙酸 (TFA) / 水 +0.1% TFA, 在 40℃ 下在 5 分钟内梯度为 5 : 95-95 : 5。

[0692] MS :Quadrupol 电喷雾离子化, 80V (正模式)

[0693] 化合物 I 及其可农用盐适合以异构体混合物形式和纯异构体形式用作除草剂。它们适合直接使用或适合以适当配制的组合物使用。包含化合物 I 或 Ia 的除草组合物非常有效地防治非作物区域的植物生长, 在高施用率下尤其如此。它们在诸如小麦、稻、玉米、大豆和棉花的作物中作用于阔叶杂草和禾本科杂草而不对作物植株引起任何显著的损害。该效果主要在低施用率下观察到。

[0694] 取决于所述施用方法, 化合物 I 或 Ia, 或者包含它们的组合物可以额外用于许多其它作物植株以消除不希望的植物。合适的作物实例如下 :

[0695] 洋葱 (*Allium cepa*)、凤梨 (*Ananas comosus*)、落花生 (*Arachishypogaea*)、石刁柏 (*Asparagus officinalis*)、燕麦 (*Avena sativa*)、甜菜 (*Betavulgaris spec. altissima*)、甜菜 (*Beta vulgaris spec. rapa*)、欧洲油菜 (*Brassiccanapus var. napus*)、芜菁甘蓝 (*Brassica napus var. napobrassica*)、芜菁 (*Brassica rapa var. silvestris*)、羽衣甘蓝 (*Brassica oleracea*)、黑芥 (*Brassicanigra*)、大叶茶 (*Camellia sinensis*)、红花 (*Carthamus tinctorius*)、美国山核桃 (*Carya illinoiensis*)、柠檬 (*Citrus limon*)、甜橙 (*Citrus sinensis*)、小果咖啡 (*Coffea arabica*) (中果咖啡 (*Coffea canephora*)、大果咖啡 (*Coffealiberica*))、黄瓜 (*Cucumis sativus*)、狗牙根 (*Cynodon dactylon*)、胡萝卜 (*Daucus carota*)、油棕 (*Elaeis guineensis*)、欧洲草莓 (*Fragaria vesca*)、大豆 (*Glycine max*)、陆地棉 (*Gossypium hirsutum*) (树棉 (*Gossypiumarboreum*)、草棉 (*Gossypium herbaceum*)、*Gossypium vitifolium*)、向日葵 (*Helianthus annuus*)、橡胶 (*Hevea brasiliensis*)、大麦 (*Hordeum vulgare*)、啤酒花 (*Humulus lupulus*)、甘薯 (*Ipomoea batatas*)、核桃 (*Juglans regia*)、兵豆 (*Lens culinaris*)、亚麻 (*Linum usitatissimum*)、番茄 (*Lycopersiconlycopersicum*)、苹果属 (*Malus spec.*)、木薯 (*Manihot esculenta*)、紫苜蓿 (*Medicago sativa*)、芭蕉属 (*Musa spec.*)、烟草 (*Nicotiana tabacum*) (黄花烟草 (*N. rustica*))、油橄榄 (*Olea europaea*)、稻 (*Oryza sativa*)、金甲豆 (*Phaseolus lunatus*)、菜豆 (*Phaseolus vulgaris*)、黑挪威云杉 (*Picea abies*)、松属 (*Pinus spec.*)、开心果 (*Pistacia vera*)、豌豆 (*Pisum sativum*)、欧洲甜樱桃 (*Prunus avium*)、桃 (*Prunus persica*)、西洋梨 (*Pyrus communis*)、杏 (*Prunus armeniaca*)、欧洲酸樱桃 (*Prunus cerasus*)、扁桃 (*Prunus dulcis*) 和欧洲李 (*Prunus domestica*)、*Ribes sylvestre*、蓖麻 (*Ricinus communis*)、甘蔗 (*Saccharum officinarum*)、黑麦 (*Secale cereale*)、白

芥 (*Sinapis alba*)、马铃薯 (*Solanum tuberosum*)、两色蜀黍 (*Sorghum bicolor*) (蜀黍 (*S. vulgare*))、可可树 (*Theobroma cacao*)、红车轴草 (*Trifolium pratense*)、小黑麦 (*Triticale*)、普通小麦 (*Triticum aestivum*)、硬粒小麦 (*Triticum durum*)、蚕豆 (*Vicia faba*)、葡萄 (*Vitis vinifera*) 和玉蜀黍 (*zea mays*)。

[0696] 此外,式 I 化合物还可以用于因包括基因工程方法在内的育种而耐受除草剂作用的作物。

[0697] 此外,化合物 I 还可以用于因包括基因工程在内的育种而耐受昆虫或真菌侵袭的作物。

[0698] 此外,已经发现式 I 化合物还适于植物部分的脱叶和 / 或干燥,对此合适的是作物植株如棉花、土豆、油籽油菜、向日葵、大豆或蚕豆,尤其是棉花。就此而言,已经发现用于植物干燥和 / 或脱叶的组合物、制备这些组合物的方法以及使用式 I 化合物干燥和 / 或脱叶植物的方法。

[0699] 作为干燥剂,式 I 化合物特别适于干燥作物植株如土豆、油籽油菜、向日葵和大豆以及禾谷类的地面上部分。这使得这些重要作物植株的完全机械化收获成为可能。

[0700] 还具有经济益处的是促进柑橘类水果、橄榄和其它品种的害水果 (pernicious fruit)、核果和坚果的收获,这通过在一定时间期限内集中裂开或降低对树的粘附而成为可能。相同的机理,即促进水果部分或叶部分与植物的枝部分之间发生脱离对于有用植物,尤其是棉花的受控脱叶也是必不可少的。

[0701] 此外,各棉花植株成熟的时间间隔缩短导致收获后的纤维质量提高。

[0702] 化合物 I 或包含它们的除草组合物例如可以以即喷水溶液,粉末,悬浮液以及高度浓缩的水性、油性或其它悬浮液或分散体,乳液,油分散体,糊,粉剂,撒播用材料或颗粒的形式通过喷雾、雾化、撒粉、撒播或浇灌或处理种子或与种子混合而使用。使用形式取决于意欲的目的;在任何情况下都应确保本发明活性成分最佳可能地分布。

[0703] 除草组合物包含除草有效量的至少一种式 I 化合物或 I 的可农用盐和常用于配制作物保护试剂的助剂。

[0704] 常用于配制作物保护试剂的助剂实例是惰性助剂,固体载体,表面活性剂 (如分散剂、保护性胶体、乳化剂、润湿剂和增粘剂),有机和无机增稠剂,杀菌剂,防冻剂,消泡剂,任选还有着色剂以及用于种子配制剂的粘合剂。

[0705] 增稠剂 (即赋予配制剂以改性的流动性能,即静止状态下的高粘度和运动状态下的低粘度的化合物) 的实例是多糖,如黄原胶 (来自 Kelco 的 **Kelzan**[®]), **Rhodopol**[®] 23 (Rhone Poulenc) 或 **Veegum**[®] (来自 R. T. Vanderbilt), 以及有机和无机片状矿物,如 **Attaclay**[®] (来自 Engelhardt)。

[0706] 消泡剂实例是聚硅氧烷乳液 (如 **Silikon**[®] SRE, Wacker 或 **Rhodorsil**[®], 来自 Rhodia), 长链醇, 脂肪酸, 脂肪酸盐, 有机氟化合物及其混合物。

[0707] 可以加入杀菌剂以稳定含水除草配制剂。杀菌剂实例是基于二氯芬和苄醇半缩甲醛的杀菌剂 (ICI 的 **Proxel**[®] 或 Thor Chemie 的 **Acticide**[®] RS 以及 Rohm & Haas 的 **Kathon**[®] MK), 还有异噻唑啉酮衍生物, 如烷基异噻唑啉酮类和苯并异噻唑啉酮类 (Thor Chemie 的 Acticide MBS)。

[0708] 防冻剂实例是乙二醇、丙二醇、脲或甘油。

[0709] 着色剂的实例是微水溶性颜料和水溶性染料。可以提到的实例是以如下名称已知的染料：若丹明 B, C. I. 颜料红 112 和 C. I. 溶剂红 1, 以及颜料蓝 15:4, 颜料蓝 15:3, 颜料蓝 15:2, 颜料蓝 15:1, 颜料蓝 80, 颜料黄 1, 颜料黄 13, 颜料红 112, 颜料红 48:2, 颜料红 48:1, 颜料红 57:1, 颜料红 53:1, 颜料橙 43, 颜料橙 34, 颜料橙 5, 颜料绿 36, 颜料绿 7, 颜料白 6, 颜料棕 25, 碱性紫 10, 碱性紫 49, 酸性红 51, 酸性红 52, 酸性红 14, 酸性蓝 9, 酸性黄 23, 碱性红 10, 碱性红 108。

[0710] 粘合剂的实例是聚乙烯吡咯烷酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇和纤基乙酸钠。

[0711] 合适的惰性助剂例如为下列物质：中沸点至高沸点的矿物油馏分如煤油和柴油，此外还有煤焦油和植物或动物来源的油，脂族、环状和芳族烃如石蜡，四氢化萘，烷基化萘及其衍生物，烷基化苯及其衍生物，醇类如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇和环己醇，酮类如环己酮，强极性溶剂，例如胺类如 N-甲基吡咯烷酮，和水。

[0712] 固体载体为矿土如硅石、硅胶、硅酸盐、滑石、高岭土、石灰石、石灰、白垩、红玄武土、黄土、粘土、白云石、硅藻土、硫酸钙、硫酸镁和氧化镁，磨碎的合成材料，肥料如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵和脲类以及植物来源的产品如谷粉、树皮粉、木粉和坚果壳粉，纤维素粉或其它固体载体。

[0713] 合适的表面活性剂（助剂、润湿剂、增粘剂、分散剂和乳化剂）是芳族磺酸如木素磺酸（例如 Borrespers 类型, Borregaard）、苯酚磺酸、萘磺酸（Morwet 类型, Akzo Nobel）和二丁基萘磺酸（Nekal 类型, BASF AG）以及脂肪酸的碱金属盐、碱土金属盐和铵盐，烷基-和烷基芳基磺酸盐，烷基硫酸盐，月桂基醚硫酸盐和脂肪醇硫酸盐，以及硫酸化十六-、十七-和十八烷醇的盐，还有脂肪醇乙二醇醚的盐，磺化萘及其衍生物与甲醛的缩合物，萘或萘磺酸与苯酚和甲醛的缩合物，聚氧乙烯辛基酚醚，乙氧基化异辛基-、辛基-或壬基酚，烷基苯基或三丁基苯基聚乙二醇醚，烷基芳基聚醚醇，异十三烷醇，脂肪醇/氧化乙烯缩合物，乙氧基化蓖麻油，聚氧乙烯烷基醚或聚氧丙烯烷基醚，月桂醇聚乙二醇醚乙酸酯，山梨糖醇酯，木素亚硫酸盐废液和蛋白质，变性蛋白质，多糖（如甲基纤维素），疏水改性的淀粉，聚乙烯醇（Mowiol 类型, Clariant），聚羧酸盐类（BASF AG, Sokalan 类型），聚烷氧基化物，聚乙烯胺（BASF AG, Lupamine 类型），聚乙烯亚胺（BASF AG, Lupasol 类型），聚乙烯基吡咯烷酮及其共聚物。

[0714] 粉末、撒播用材料和粉剂可以通过将活性成分与固体载体混合或研磨来制备。

[0715] 颗粒如包衣颗粒、浸渍颗粒和均质颗粒可以通过使活性成分与固体载体粘附而制备。

[0716] 含水使用形式可以通过添加水由乳油、悬浮液、糊、可湿性粉末或水分散性颗粒制备。为了制备乳液、糊或油分散体，可以借助湿润剂、增粘剂、分散剂或乳化剂将式 I 或 Ia 化合物直接或溶于油或溶剂之后在水中均化。或者还可以制备包含活性物质、湿润剂、增粘剂、分散剂或乳化剂以及需要的话，溶剂或油的浓缩物，该类浓缩物适于用水稀释。

[0717] 式 I 化合物在即用制剂中的浓度可以在宽范围内变化。配制剂通常包含 0.001-98 重量%，优选 0.01-95 重量%至少一种活性成分。活性成分以 90-100%，优选 95-100%（根据 NMR 光谱）的纯度使用。

[0718] 本发明化合物 I 例如可以按如下配制：

[0719] 1. 用水稀释的产品

[0720] A 水溶性浓缩物

[0721] 将 10 重量份活性物质溶于 90 重量份水或水溶性溶剂中。或者,加入湿润剂或其它助剂。活性物质经水稀释溶解。这得到活性物质含量为 10 重量%的配制剂。

[0722] B 分散性浓缩物

[0723] 将 20 重量份活性物质溶于 70 重量份环己酮中并加入 10 重量份分散剂如聚乙烯基吡咯烷酮。用水稀释得到分散体。活性物质含量为 20 重量%。

[0724] C 乳油

[0725] 将 15 重量份活性物质溶于 75 重量份有机溶剂(如烷基芳烃)中并加入十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物(在每种情况下为 5 重量份)。用水稀释得到乳液。该配制剂的活性物质含量为 15 重量%。

[0726] D 乳液

[0727] 将 25 重量份活性物质溶于 35 重量份有机溶剂(如烷基芳烃)中并加入十二烷基苯磺酸钙和蓖麻油乙氧基化物(在每种情况下为 5 重量份)。借助乳化机(Ultraturrax)将该混合物引入 30 重量份水中并制成均相乳液。用水稀释得到乳液。该配制剂的活性物质含量为 25 重量%。

[0728] E 悬浮液

[0729] 在搅拌的球磨机中,将 20 重量份活性物质粉碎并加入 10 重量份分散剂和湿润剂以及 70 重量份水或有机溶剂,得到细碎活性物质悬浮液。用水稀释得到稳定的活性物质悬浮液。该配制剂中活性物质含量为 20 重量%。F 水分散性颗粒和水溶性颗粒

[0730] 将 50 重量份活性物质细碎研磨并加入 50 重量份分散剂和湿润剂,借助工业装置(如挤出机、喷雾塔、流化床)将其制成水分散性或水溶性颗粒。用水稀释得到稳定的活性物质分散体或溶液。该配制剂的活性物质含量为 50 重量%。

[0731] G 水分散性粉末和水溶性粉末

[0732] 将 75 重量份活性物质在转子-定子磨机中研磨并加入 25 重量份分散剂、湿润剂和硅胶。用水稀释得到稳定的活性物质分散体或溶液。该配制剂的活性物质含量为 75 重量%。

[0733] H 凝胶配制剂

[0734] 在球磨机中研磨 20 重量份活性物质、10 重量份分散剂、1 重量份胶凝剂和 70 重量份水或有机溶剂,得到细悬浮液。用水稀释得到活性物质含量为 20 重量%的稳定悬浮液。

[0735] 2. 不经稀释而施用的产品

[0736] I 粉剂

[0737] 将 5 重量份活性物质细碎研磨并与 95 重量份细碎高岭土充分混合。这得到活性物质含量为 5 重量%的可撒粉(tracking)粉末。

[0738] J 颗粒(GR, FG, GG, MG)

[0739] 将 0.5 重量份活性物质细碎研磨并结合 95.5 重量份载体。现行方法是挤出、喷雾干燥或流化床方法。这得到不经稀释而施用的活性物质含量为 0.5 重量%的颗粒。

[0740] K ULV 溶液(UL)

[0741] 将 10 重量份活性物质溶于 90 重量份有机溶剂如二甲苯中。这得到不经稀释而施

用的活性物质含量为 10 重量%的产品。

[0742] 下面给出具体配制剂：

[0743] I 将 20 重量份式 I 化合物溶于由 80 重量份烷基化苯、10 重量份的 8-10mol 氧化乙烯与 1mol 油酸 N- 单乙醇酰胺的加合物、5 重量份十二烷基苯磺酸钙和 5 重量份的 40mol 氧化乙烯与 1mol 蓖麻油的加合物组成的混合物中。将该溶液倾入 100000 重量份水中并在其中精细分散，得到包含 0.02 重量%活性化合物的水分散体。

[0744] II 将 20 重量份式 I 化合物溶于由 40 重量份环己酮、30 重量份异丁醇、20 重量份的 7mol 氧化乙烯与 1mol 异辛基苯酚的加合物和 10 重量份的 40mol 氧化乙烯与 1mol 蓖麻油的加合物组成的混合物中。将该溶液倾入 100000 重量份水中并在其中精细分散，得到包含 0.02 重量%活性化合物的水分散体。

[0745] III 将 20 重量份式 I 化合物溶于由 25 重量份环己酮、65 重量份沸点为 210-280C 的矿物油馏分和 10 重量份的 40mol 氧化乙烯与 1mol 蓖麻油的加合物组成的混合物中。将该溶液倾入 100000 重量份水中并在其中精细分散，得到包含 0.02 重量%活性化合物的水分散体。

[0746] IV 将 20 重量份式 I 化合物与 3 重量份二异丁基萘磺酸钠、17 重量份来自亚硫酸盐废液的木素磺酸钠盐和 60 重量份粉状硅胶彻底混合并将混合物在锤磨机中研磨。将该混合物精细分散于 20000 重量份水中，得到包含 0.1 重量%活性化合物的喷雾混合物。

[0747] V 将 3 重量份式 I 化合物与 97 重量份细碎高岭土混合。得到包含 3 重量%活性化合物的粉剂。

[0748] VI 将 20 重量份式 I 化合物与 2 重量份十二烷基苯磺酸钙、8 重量份脂肪醇聚乙二醇醚、2 重量份苯酚 / 脲 / 甲醛缩合物的钠盐和 68 重量份链烷烃矿物油均匀混合。得到稳定的油性分散体。

[0749] VII 将 1 重量份式 I 化合物溶于由 70 重量份环己酮、20 重量份乙氧基化异辛基苯酚和 10 重量份乙氧基化蓖麻油组成的混合物中。得到稳定的乳油。

[0750] VIII 将 1 重量份式 I 化合物溶于由 80 重量份环己酮和 20 重量份 **Wettol**[®] EM 31 (基于乙氧基化蓖麻油的非离子乳化剂) 组成的混合物中。得到稳定的乳油。

[0751] 化合物 I 或包含它们的除草组合物可以出苗前或出苗后施用，或者与作物植物的种子一起施用。还可以通过施用被除草组合物或活性化合物预处理的作物植物的种子而施用除草组合物或活性化合物。若活性成分不能被某些作物植株良好地耐受，则可以使用其中借助喷雾设备喷雾除草组合物以使它们尽可能不接触敏感作物植株的叶子，而活性成分到达生长在下面的不希望的植物的叶子或裸露的土壤表面的施用技术（后引导，最后耕作程序）。

[0752] 在另一实施方案中，可以通过处理种子而施用式 I 化合物或其除草组合物。

[0753] 种子的处理基本包括所有本领域熟练技术人员熟知的基于本发明式 I 化合物或由其制备的组合物程序（拌种、种子包衣、种子撒粉、种子浸泡、种子包膜、种子多层包衣、种子包壳、种子浸滴和种子造粒）。这里可以加以稀释或不加稀释地施用除草组合物。

[0754] 术语种子包括所有类型的种子，如玉米、种子、果实、块茎、秧苗和类似形式。这里优选术语种子描述的是玉米和种子。

[0755] 所用种子可以是上述有用植物的种子，但还可以是转基因植物或通过常规育种方

法得到的植物的种子。

[0756] 活性化合物的施用率为 0.001-3.0kg/ha, 优选 0.01-1.0kg/ha 活性物质(a. s.), 取决于防治目标、季节、目标植物和生长阶段。为了处理种子, 化合物 I 通常以 0.001-10kg/100kg 种子的量使用。

[0757] 为了拓宽作用谱并实现协同增效效果, 可以将式 I 化合物与大量其它除草或生长调节活性成分的代表混合, 然后同时施用。用于混合物的合适组分例如为 1,2,4- 噁二唑类, 1,3,4- 噁二唑类, 酰胺类, 氨基磷酸及其衍生物, 氨基三唑类, 酰替苯胺类, (杂) 芳氧基链烷酸及其衍生物, 苯甲酸及其衍生物, 苯并噁二嗪酮类, 2- 芳酰基 -1,3- 环己烷二酮类, 2- 杂芳酰基 -1,3- 环己烷二酮类, 杂芳基芳基酮类, 苄基异噁唑烷酮类, 间 -CF₃- 苯基衍生物, 氨基甲酸酯类, 喹啉羧酸及其衍生物, 氯代乙酰苯胺类, 环己酮肟醚衍生物, 二嗪类, 二氯丙酸及其衍生物, 二氢苯并呋喃, 二氢呋喃 -3- 酮类, 二硝基苯胺类, 二硝基苯酚类, 二苯基醚类, 联吡啶类, 卤代羧酸及其衍生物, 脲类, 3- 苯基尿嘧啶类, 咪唑类, 咪唑啉酮类, N- 苯基 -3,4,5,6- 四氢邻苯二甲酰亚胺类, 噁二唑类, 环氧乙烷类, 酚类, 芳氧基 - 和杂芳氧基苯氧基丙酸酯, 苯基乙酸及其衍生物, 苯基丙酸及其衍生物, 吡唑类, 苯基吡唑类, 哒嗪类, 吡啶羧酸及其衍生物, 嘧啶基醚类, 磺酰胺类, 磺酰脲类, 三嗪类, 三嗪酮类, 三唑啉酮类, 三唑羧酰胺, 尿嘧啶类, 苯基吡唑啉类和异噁唑啉类及其衍生物。

[0758] 此外, 可能有利的是单独或与其它除草剂组合施用化合物 I, 或者以与其它作物保护试剂的混合物形式施用化合物 I, 例如与用于防治害虫或植物病原性真菌或细菌的试剂一起施用化合物 I。还令人感兴趣的是与无机盐溶液的溶混性, 所述盐溶液用于治疗营养和痕量元素缺乏。还可以加入其它添加剂如非植物毒性油和油浓缩物。

[0759] 部分 B

[0760] 用途实施例

[0761] 式 I 化合物的除草活性由如下温室试验证实:

[0762] 所用培养容器为含有含约 3.0% 腐殖土的壤质砂作为底物的塑料花盆。对每一品种单独播种测试植物的种子。

[0763] 对于出苗前处理, 直接在播种之后借助细分布喷嘴施用悬浮或乳化于水中的活性成分。温和灌溉容器以促进发芽和生长, 然后用透明塑料罩覆盖, 直到植物生根。该覆盖导致测试植物均匀发芽, 除非被活性成分损坏。

[0764] 对于出苗后处理, 首先使测试植物生长到 3-15cm 的高度, 这取决于植物习性, 并且仅在此时用悬浮或乳化于水中的活性成分处理。为此, 将测试植物直接播种并在相同容器中生长, 或者首先使它们作为秧苗单独生长并在处理之前几天移植到测试容器中。

[0765] 取决于品种, 将植物保持在 10-25℃ 或 20-35℃。测试期为 2-4 周。在此期间照料植物并评价它们对各处理的响应。

[0766] 使用 0-100 的评分进行评价。100 表示没有植物出苗, 或者至少地面上部分完全受损, 而 0 表示没有损害, 或者生长过程正常。对良好的除草活性给予至少 70 的分值, 而对非常良好的除草活性给予至少 85 的分值。

[0767] 用于温室试验中的植物属于下列种属:

[0768]

学名	通用名
绿穗苋 (<i>Amaranthus retroflexus</i>) (AMARE)	反枝苋
藜 (<i>Chenopodium album</i>) (CHEAL)	藜

[0769]

学名	通用名
狗尾草 (<i>Setaria viridis</i> (SETVI))	狗尾草
大狗尾草 (<i>Setaria faberi</i> (SETFA))	大狗尾草
稗 (<i>Echinochloa crus galli</i> (ECHCG))	稗
大穗看麦娘 (<i>Alopecurus myosuroides</i>) (ALOMY)	鼠尾看麦娘
野燕麦 (<i>Avena fatua</i> (AVEFA))	野燕麦
黑麦草 (<i>Lolium perenne</i> (LOLMU))	多花黑麦草
阿披拉草 (<i>Apera spica-venti</i> (APESV))	风剪股颖

[0770] 化合物 A. 1. 10、A. 1. 11、A. 2. 81、A. 2. 97、A. 2. 135、A. 2. 136、A. 2. 222、A. 2. 223、A. 2. 224、A. 2. 226 和 A. 2. 267 在通过出苗后方法施用显示出非常良好的除草活性。

[0771] 在 1kg/ha 的施用率下, 化合物 A. 1. 10、A. 1. 11、A. 2. 135、A. 2. 222、A. 2. 223 和 A. 2. 224 对 CHEAL 具有非常良好的出苗后除草活性。

[0772] 在 1kg/ha 的施用率下, 化合物 A. 1. 10、A. 1. 11、A. 2. 135、A. 2. 222、A. 2. 223、A. 2. 224、A. 2. 226 和 A. 2. 267 对 AMARE 具有非常良好的出苗后除草活性。

[0773] 在 1kg/ha 的施用率下, 化合物 A. 1. 10、A. 1. 11、A. 2. 97、A. 2. 136、A. 2. 222、A. 2. 223 和 A. 2. 226 对 SETVI 具有非常良好的出苗后除草活性。

[0774] 在 1kg/ha 的施用率下, 化合物 A. 2. 97、A. 2. 136 和 A. 2. 224 对 LOLMU 具有非常良好的出苗后除草活性。

[0775] 在 3kg/ha 的施用率下, 化合物 A. 2. 81 对 ECHCG 具有非常良好的出苗后除草活性。在 1kg/ha 的施用率下, 化合物 A. 2. 226 和 A. 2. 267 对 ECHCG 具有非常良好的出苗后除草活性。

[0776] 在 3kg/ha 的施用率下, 化合物 A. 2. 105 对 ALOMY 和 AVEFA 具有非常良好的出苗后除草活性。

[0777] 在 3kg/ha 的施用率下, 化合物 A. 2. 64、A. 2. 65、A. 2. 133、A. 2. 135、A. 2. 251、A. 2. 255、A. 2. 265、A. 2. 267、A. 2. 273、A. 2. 274 和 A. 2. 275 对 SETFA 具有良好至非常良好的

出苗后除草活性。在 1kg/ha 的施用率下,化合物 A. 2. 224 对 SETFA 具有良好至非常良好的出苗后除草活性。

[0778] 在 3kg/ha 的施用率下,化合物 A. 2. 64、A. 2. 105、A. 2. 133、A. 2. 135、A. 2. 265、A. 2. 267、A. 2. 273、A. 2. 274 和 A. 2. 275 对 ECHCG 具有良好至非常良好的出苗前除草活性。

[0779] 在 3kg/ha 的施用率下,化合物 A. 1. 13、A. 5. 16、A. 2. 135、A. 2. 265、A. 2. 267、A. 2. 271、A. 2. 273 和 A. 2. 276 对 SETIT 具有良好至非常良好的出苗前除草活性。

[0780] 在 1kg/ha 的施用率下,化合物 A. 2. 97、A. 2. 136、A. 2. 224 和 A. 2. 267 对 APESV 具有非常良好的出苗前除草活性。

[0781] 在 3kg/ha 的施用率下,化合物 A. 2. 81 对 SETFA 具有非常良好的出苗前除草活性。

[0782] 在 0. 5kg/ha 的施用率下,化合物 A. 5. 17 对 APESV 和 AMARE 分别具有良好和非常良好的出苗前除草活性。