



(10) 授权公告号 CN 114555563 B

(45) 授权公告日 2024.11.15

(21) 申请号 202080051179.7

(22) 申请日 2020.07.17

(65) 同一申请的已公布的文献号  
申请公布号 CN 114555563 A

(43) 申请公布日 2022.05.27

(30) 优先权数据  
1910290.4 2019.07.18 GB

(85) PCT国际申请进入国家阶段日  
2022.01.14

(86) PCT国际申请的申请数据  
PCT/EP2020/070242 2020.07.17

(87) PCT国际申请的公布数据  
W02021/009334 EN 2021.01.21

(73) 专利权人 先正达农作物保护股份公司  
地址 瑞士巴塞尔

(72) 发明人 K·B·凌 P·T·塞丹  
C·J·马修斯 S·E·沙纳翰  
C·基斯奥 J·芬尼

(74) 专利代理机构 中国贸促会专利商标事务所  
有限公司 11038

专利代理师 张敏

(51) Int.Cl.  
C07D 237/16 (2006.01)  
C07D 401/10 (2006.01)  
C07D 403/10 (2006.01)  
C07D 409/10 (2006.01)  
C07D 413/10 (2006.01)  
C07D 417/10 (2006.01)  
A01N 43/58 (2006.01)  
A01N 43/653 (2006.01)  
A01N 43/76 (2006.01)  
A01N 43/78 (2006.01)  
A01N 43/824 (2006.01)  
A01P 13/00 (2006.01)

(56) 对比文件  
WO 2019137851 A1, 2019.07.18  
WO 2020114869 A1, 2020.06.11

审查员 史骄阳

权利要求书2页 说明书160页

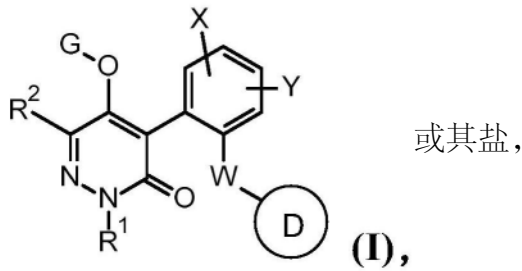
(54) 发明名称

取代的哒嗪酮作为除草剂

(57) 摘要

本发明涉及具有式(I)的除草剂经取代的苯基-哒嗪-二酮和经取代的苯基-哒嗪酮衍生物,以及用于制备此类衍生物的方法和中间体。本发明进一步延伸到包含此类衍生物的除草组合物,以及此类化合物和组合物在有用植物的作物中控制不希望的植物生长的用途:特别地控制杂草如阔叶双子叶杂草的用途。

1. 一种具有式 (I) 的化合物



其中,

$R^1$  选自由以下组成的组:  $C_1-C_4$  烷基;

$R^2$  选自由以下组成的组:  $C_1-C_6$  烷基;

G 是氢或  $C(O)R^3$ ;

$R^3$  是异丙基、叔丁基、甲基、乙基、炔丙基、甲氧基、乙氧基、或叔丁氧基;

$R^4$  和  $R^5$  各自独立地是氢或  $C_1-C_4$  烷基; 并且,

X 和 Y 各自独立地是氢或卤素;

D 是包含 1、2 或 3 个独立地选自氧、氮和硫的杂原子的经取代的单环杂芳基环, 其在至少一个环碳原子上被  $R^8$  取代和/或在至少一个环氮原子上被  $R^9$  取代;

至少一个  $R^8$  选自由以下组成的组:  $-C_1-C_3$  烷基- $S(O)_m-C_1-C_6$  烷基、 $-S(O)_2NHC(O)C_1-C_3$  烷基、 $-S(O)_2NR^4R^5$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OC_1-C_6$  烷基、 $-C(O)NR^4R^5$ 、 $-NR^4C(O)NR^4R^5$ 、 $C_1-C_6$  烷基羰基 ( $C_1-C_6$  烷基) 氨基-、以及选自由苯基环、5-6 元杂芳基环和 3-6 元杂环基环组成的组的环体系, 其中所述环体系被 0 至 5 个  $R^{16}$  取代;

至少一个  $R^9$  选自由以下组成的组:  $C_3-C_6$ -环烷基;

任何另外的  $R^8$  取代基选自由以下组成的组: 卤素、 $C_1-C_6$  烷基和  $C_1-C_6$  卤代烷基;

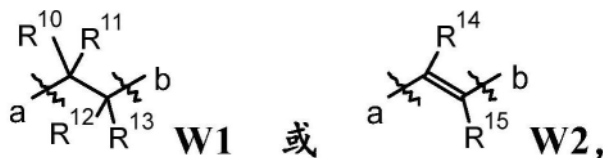
m 是 0 或 2 的整数;

每个  $R^{16}$  独立地是卤素或  $C_1-C_6$  烷基;

或 D 是被至少一个  $R^8$  取代的苯基环;

并且,

W 是



其中:

“a”表示与苯基-咪唑二酮/苯基-咪唑酮部分的附接点,

“b”表示与环 D 的附接点,

$R^{10}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{14}$  和  $R^{15}$  各自独立地是氢; 并且

$R^{11}$  和  $R^{13}$  各自是氢。

2. 根据权利要求 1 所述的化合物, 其中, 相对于所述咪唑酮/咪唑-二酮部分, X 是在邻位。

3. 根据权利要求 1 所述的化合物, 其中, 相对于所述 -W-D 部分, Y 是在邻位。

4. 根据权利要求1所述的化合物,其中,W是W1并且R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>各自是氢。
5. 根据权利要求1所述的化合物,其中,W是W2并且R<sup>14</sup>和R<sup>15</sup>各自是氢。
6. 一种除草组合物,其包含根据权利要求1-5中任一项所述的除草化合物、和农业上可接受的配制辅助剂。
7. 根据权利要求6所述的除草组合物,其进一步包含至少一种额外的杀有害生物剂。
8. 根据权利要求7所述的除草组合物,其中,所述额外的杀有害生物剂是除草剂或除草剂安全剂。
9. 一种控制不想要的植物生长的方法,所述方法包括将权利要求1至5中任一项所定义的具有式(I)的化合物或根据权利要求6至8中任一项所述的除草组合物施用至不想要的植物或其场所。
10. 权利要求1至5中任一项所定义的具有式(I)的化合物作为除草剂的用途。

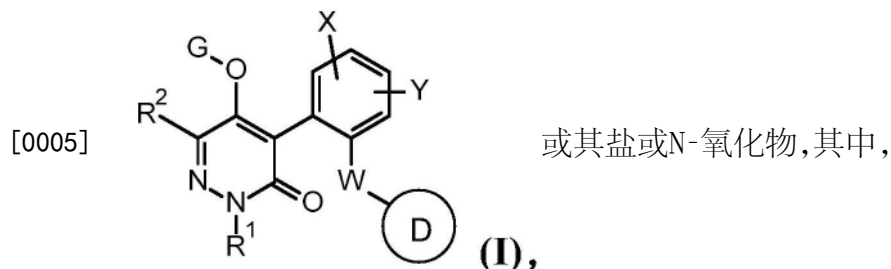
## 取代的哒嗪酮作为除草剂

[0001] 本发明涉及具有式 (I) 的除草剂经取代的苯基-哒嗪-二酮和经取代的苯基-哒嗪酮衍生物,以及用于制备此类衍生物的方法和中间体。本发明进一步延伸到包含此类衍生物的除草组合物,以及此类化合物和组合物在有用植物的作物中控制不希望的植物生长的用途:特别地控制杂草如阔叶双子叶杂草的用途。

[0002] 除草剂哒嗪酮是从WO 2009/086041已知的。此外,除草剂5/6元杂环基取代的哒嗪酮是从WO 2011/045271已知的。同时WO 2013/160126描述了吡啶基-哒嗪酮衍生物,这些衍生物展示出除草活性。

[0003] 本发明是基于以下发现:具有式 (I) 的经取代的苯基-哒嗪-二酮和经取代的苯基-哒嗪酮衍生物展示了出人意料地良好的除草活性。

[0004] 因此,在第一方面,提供了一种具有式 (I) 的化合物



[0006]  $R^1$ 选自由以下组成的组: $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_3$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_2$ 烷氧基- $C_1$ - $C_2$ 烷基、 $C_2$ - $C_4$ 烯基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基、氰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_2$ - $C_4$ 卤代烯基、 $C_2$ - $C_4$ 炔基和 $C_2$ - $C_4$ 卤代炔基;

[0007]  $R^2$ 选自由以下组成的组:氢、卤素、氰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 羟基烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基、-S(O)<sub>m</sub>- $C_1$ - $C_6$ 烷基、氨基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基氨基、 $C_1$ - $C_6$ 二烷基氨基、-C( $C_1$ - $C_3$ 烷基)=N-O- $C_1$ - $C_3$ 烷基和 $C_2$ - $C_6$ 卤代炔基;

[0008] G是氢、或C(O) $R^3$ ;

[0009]  $R^3$ 选自由以下组成的组: $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基-S-、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>以及任选地被一个或多个R<sup>6</sup>取代的苯基;

[0010]  $R^4$ 和 $R^5$ 各自独立地选自由以下组成的组:氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基和 $C_3$ - $C_6$ 环烷基,或者 $R^4$ 和 $R^5$ 一起可以形成吗啉基环;并且,

[0011]  $R^{4a}$ 和 $R^{5a}$ 各自独立地选自由以下组成的组: $C_1$ - $C_6$ 烷氧基和 $C_3$ - $C_6$ 环烷基,或者 $R^{4a}$ 和 $R^{5a}$ 一起可以形成吗啉基环;并且,

[0012]  $R^6$ 选自由以下组成的组:卤素、氰基、硝基、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基以及 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基;

[0013] X和Y各自独立地是氢、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、环丙基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基、或卤素;

[0014] D是包含1、2或3个独立地选自氧、氮和硫的杂原子的经取代的单环杂芳基环、在至

少一个环碳原子上被 $R^8$ 取代和/或在至少一个环氮原子上被 $R^9$ 取代;

[0015] 至少一个 $R^8$ 选自由以下组成的组: $C_1-C_6$ 卤代烷基羰基-、 $C_3-C_6$ 环烷基羰基-、-S(O)<sub>m</sub>- $C_1-C_6$ 卤代烷基-、-S(O)<sub>m</sub>- $C_3-C_6$ 环烷基-、-O-S(O)<sub>2</sub> $C_1-C_3$ 烷基-、- $C_1-C_3$ 烷基-S(O)<sub>m</sub>- $C_1-C_6$ 烷基-、- $C_1-C_3$ 烷基-S(O)<sub>m</sub>- $C_1-C_6$ 卤代烷基-、- $C_1-C_3$ 烷基-S(O)<sub>m</sub>- $C_3-C_6$ 环烷基-、氰基- $C_1-C_6$ -烷基-、-NR<sup>4a</sup>R<sup>5a</sup>、-C(S)NR<sup>4R5</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NHC(O) $C_1-C_3$ 烷基-、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4R5</sup>、-C(O)OH、-C(O)OC<sub>1-C6</sub>烷基-、-C(O)NHS-(O)<sub>2</sub> $C_1-C_6$ 烷基-、-C(O)NR<sup>4R5</sup>、-NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>5</sup>、 $C_1-C_6$ 烷基羰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基羰基氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基羰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基氨基-、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基磺酰基氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基磺酰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_3-C_6$ 环烷基磺酰基氨基-、 $C_3-C_6$ 环烷基磺酰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、羟基氨基-、羟基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 烷氧基氨基-、 $C_1-C_6$ 烷氧基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、以及选自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个 $R^{16}$ 取代;

[0016] 至少一个 $R^9$ 选自由以下组成的组: $C_5-C_6$ 烷基-、 $C_5-C_6$ 卤代烷基-、 $C_3-C_6$ -环烷基-、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_3$ 烷基-、 $C_3$ 烷氧基- $C_1-C_2$ 烷基-、 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基-、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基-、 $C_1-C_6$ 羟基烷基-、- $C_1-C_3$ 烷基-S(O)<sub>m</sub>- $C_1-C_6$ 烷基-、- $C_1-C_3$ 烷基-S(O)<sub>m</sub>- $C_1-C_6$ 卤代烷基-、- $C_1-C_3$ 烷基-S(O)<sub>m</sub>- $C_3-C_6$ 环烷基-、氰基- $C_1-C_6$ -烷基-、以及选自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个 $R^{16}$ 取代;

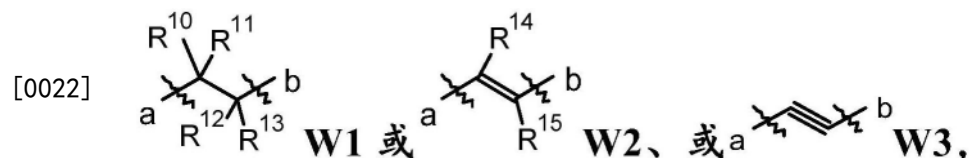
[0017] m是0、1或2的整数;

[0018] 每个 $R^{16}$ 独立地是卤素、氰基、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基或 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基;

[0019] 或D是被至少一个 $R^8$ 取代的苯基环;

[0020] 并且,

[0021] W是



[0023] 其中:

[0024] “a”表示与苯基-哒嗪二酮/苯基-哒嗪酮部分的附接点,

[0025] “b”表示与环D的附接点,

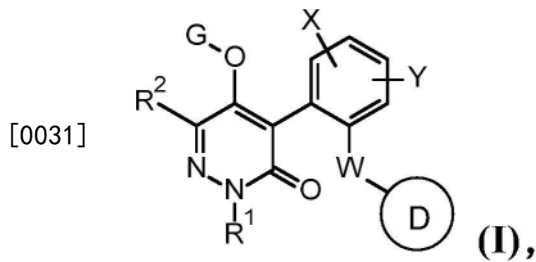
[0026]  $R^{10}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{14}$ 和 $R^{15}$ 各自独立地是氢、 $C_1-C_3$ 烷基或 $C_1-C_3$ 卤代烷基;

[0027] 或者 $R^{10}$ 和 $R^{12}$ 与它们所连接的碳原子一起形成 $C_3-C_6$ 碳环;并且

[0028]  $R^{11}$ 和 $R^{13}$ 各自独立地是氢、卤素、 $C_1-C_3$ 烷基、或 $C_1-C_3$ 卤代烷基;

[0029] 其前提是当 $R^{11}$ 或 $R^{13}$ 之一是卤素、 $C_1-C_3$ 烷基或 $C_1-C_3$ 卤代烷基时,另一个是氢。

[0030] 在第二方面,提供了一种具有式(I)的化合物



[0032] 或其盐或N-氧化物,其中,

[0033]  $R^1$ 选自由以下组成的组: $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_3$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_2$ 烷氧基- $C_1$ - $C_2$ 烷基、 $C_2$ - $C_4$ 烯基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基、氰基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_2$ - $C_4$ 卤代烯基、 $C_2$ - $C_4$ 炔基和 $C_2$ - $C_4$ 卤代炔基;

[0034]  $R^2$ 选自由以下组成的组:氢、卤素、氰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷基-、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷基-、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 羟基烷基-、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基-、-S(O)<sub>m</sub> $C_1$ - $C_6$ 烷基、-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-C( $C_1$ - $C_3$ 烷基)=N-O- $C_1$ - $C_3$ 烷基和 $C_2$ - $C_6$ 卤代炔基;

[0035] G是氢、或C(O)R<sup>3</sup>;

[0036]  $R^3$ 选自由以下组成的组: $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基-S-、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>以及任选地被一个或多个R<sup>6</sup>取代的苯基;

[0037]  $R^4$ 和 $R^5$ 各自独立地选自由以下组成的组:氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基和 $C_3$ - $C_6$ 环烷基,或者 $R^4$ 和 $R^5$ 一起可以形成吗啉基环;并且,

[0038]  $R^6$ 选自由以下组成的组:卤素、氰基、硝基、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基以及 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基;

[0039] X是环丙基(优选地,相对于哒嗪酮/哒嗪-二酮部分,X是在邻位);

[0040] Y是氢、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、环丙基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基、或卤素(相对于-W-D部分,Y是在邻位(3位));

[0041] D是包含1、2或3个独立地选自氧、氮和硫的杂原子的经取代的或未经取代的单环杂芳基环,并且其中当D被取代时,其在至少一个环碳原子上被R<sup>8</sup>取代和/或在环氮原子上被R<sup>9</sup>取代;

[0042] 每个R<sup>8</sup>独立地是氧、羟基、卤素、氰基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_3$ - $C_6$ -环烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷基-、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷基-、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代炔基、 $C_1$ - $C_6$ 羟基烷基-、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基-、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基羰基-、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基羰基-、-S(O)<sub>m</sub>- $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、-S(O)<sub>m</sub>- $C_3$ - $C_6$ 环烷基、-O-S(O)<sub>2</sub> $C_1$ - $C_3$ 烷基、- $C_1$ - $C_3$ 烷基-S(O)<sub>m</sub>- $C_1$ - $C_6$ 烷基、- $C_1$ - $C_3$ 烷基-S(O)<sub>m</sub>- $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、- $C_1$ - $C_3$ 烷基-S(O)<sub>m</sub>- $C_3$ - $C_6$ 环烷基、氰基- $C_1$ - $C_6$ -烷基-、NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-C(S)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NHC(O) $C_1$ - $C_3$ 烷基、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-C(O)OH、-C(O)OC $C_1$ - $C_6$ 烷基、-C(O)NHS-(O)<sub>2</sub> $C_1$ - $C_6$ 烷基、-C(O)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、 $C_1$ - $C_6$ 烷基羰基( $C_1$ - $C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基羰基氨基-、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基羰基( $C_1$ - $C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺酰基氨基-、 $C_1$ - $C_6$ 烷基磺酰基( $C_1$ - $C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基磺酰基氨基-、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基磺酰基( $C_1$ - $C_6$ 烷基)氨基-、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基磺酰基氨基-、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基磺酰基( $C_1$ - $C_6$ 烷基)氨基-、羟基氨基-、羟基( $C_1$ - $C_6$ 烷基)氨

基、 $C_1-C_6$ 烷氧基氨基、 $C_1-C_6$ 烷氧基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基氨基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基、或选自自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个 $R^{16}$ 取代;

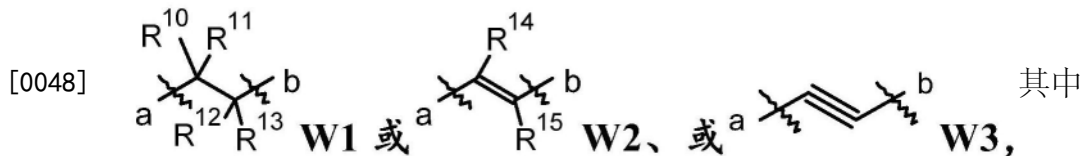
[0043]  $m$ 是0、1或2的整数(优选0或2);并且

[0044] 每个 $R^9$ 独立地是 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_3-C_6$ -环烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基-、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基-、 $C_1-C_6$ 羟基烷基-、 $C_1-C_3$ 烷基-S(O) $_m$ - $C_1-C_6$ 烷基-、 $C_1-C_3$ 烷基-S(O) $_m$ - $C_1-C_6$ 卤代烷基-、 $C_1-C_3$ 烷基-S(O) $_m$ - $C_3-C_6$ 环烷基-、氰基- $C_1-C_6$ -烷基-、或选自自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个 $R^{16}$ 取代;

[0045] 每个 $R^{16}$ 独立地是卤素、氰基、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基或 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基;

[0046] 或D是经取代或未经取代的苯基环,并且其中当所述苯基环被取代时,其被1至5个 $R^8$ 取代;

[0047] 并且,W是



[0049] “a”表示与苯基-哒嗪二酮/苯基-哒嗪酮部分的附接点,

[0050] “b”表示与环D的附接点,

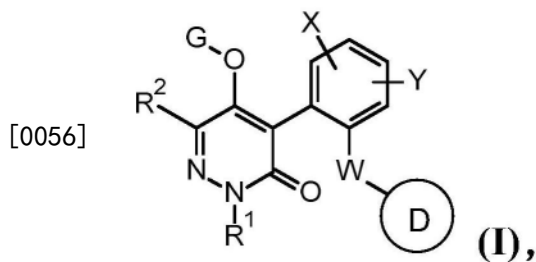
[0051]  $R^{10}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{14}$ 和 $R^{15}$ 各自独立地是氢、 $C_1-C_3$ 烷基或 $C_1-C_3$ 卤代烷基;

[0052] 或者 $R^{10}$ 和 $R^{12}$ 与它们所连接的碳原子一起形成 $C_3-C_6$ 碳环;并且

[0053]  $R^{11}$ 和 $R^{13}$ 各自独立地是氢、卤素、 $C_1-C_3$ 烷基、或 $C_1-C_3$ 卤代烷基;

[0054] 其前提是当 $R^{11}$ 或 $R^{13}$ 之一是卤素、 $C_1-C_3$ 烷基或 $C_1-C_3$ 卤代烷基时,另一个是氢。

[0055] 在第三方面,提供了一种具有式(I)的化合物



[0057] 或其盐或N-氧化物,其中,

[0058]  $R^1$ 选自由以下组成的组: $C_1-C_4$ 烷基、 $C_3-C_6$ 环烷基、 $C_3-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_2$ 烷氧基- $C_1-C_2$ 烷基、 $C_2-C_4$ 烯基、 $C_1-C_4$ 卤代烷基、氰基- $C_1-C_4$ 烷基、 $C_2-C_4$ 卤代烯基、 $C_2-C_4$ 炔基和 $C_2-C_4$ 卤代炔基;

[0059]  $R^2$ 选自由以下组成的组:氢、卤素、氰基、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基、 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基-、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基-、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基-、 $C_3-C_6$ 环烷基、 $C_2-C_6$ 烯基、 $C_2-C_6$ 卤代烯基、 $C_2-C_6$ 炔基、 $C_1-C_6$ 羟基烷基-、 $C_1-C_6$ 烷基羰基-、-S(O) $_m$ - $C_1-C_6$ 烷基-、-NR $^4$ R $^5$ -、-C( $C_1-C_3$ 烷基)=N-O- $C_1-C_3$ 烷基和 $C_2-C_6$ 卤代炔基;

[0060] G是氢、或C(O)R<sup>3</sup>;

[0061] R<sup>3</sup>选自由以下组成的组:C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-S-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>以及任选地被一个或多个R<sup>6</sup>取代的苯基;

[0062] R<sup>4</sup>和R<sup>5</sup>各自独立地选自由以下组成的组:氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基,或者R<sup>4</sup>和R<sup>5</sup>一起可以形成吗啉基环;并且,

[0063] R<sup>6</sup>选自由以下组成的组:卤素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基以及C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷氧基;

[0064] X是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、环丙基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷氧基、或卤素(优选地,相对于哒嗪酮/哒嗪-二酮部分,X是在邻位);

[0065] Y是环丙基(优选地,相对于-W-D部分,Y是在邻位);

[0066] D是包含1、2或3个独立地选自氧、氮和硫的杂原子的经取代的或未经取代的单环杂芳基环,并且其中当D被取代时,其在至少一个环碳原子上被R<sup>8</sup>取代和/或在环氮原子上被R<sup>9</sup>取代;

[0067] 每个R<sup>8</sup>独立地是氧、羟基、卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>羟基烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基、-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基羰基、-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、-O-S(O)<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-C(S)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NHC(O)C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-C(O)OH、-C(O)OC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、-C(O)NHS-(O)<sub>2</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、-C(O)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基磺酰基氨基、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基磺酰基氨基、-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、羟基氨基、羟基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、或选自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个R<sup>16</sup>取代;

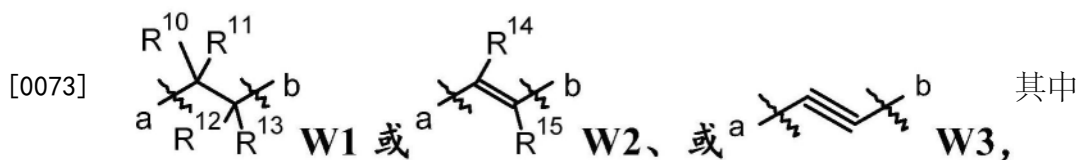
[0068] m是0、1或2的整数;并且

[0069] 每个R<sup>9</sup>独立地是C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>羟基烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、或选自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个R<sup>16</sup>取代;

[0070] 每个R<sup>16</sup>独立地是卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基;

[0071] 或D是经取代或未经取代的苯基环,并且其中当所述苯基环被取代时,其被1至5个R<sup>8</sup>取代;并且,

[0072] W是



[0074] “a”表示与苯基-哒嗪二酮/苯基-哒嗪酮部分的附接点，

[0075] “b”表示与环D的附接点，

[0076]  $R^{10}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{14}$ 和 $R^{15}$ 各自独立地是氢、 $C_1$ - $C_3$ 烷基或 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基；

[0077] 或者 $R^{10}$ 和 $R^{12}$ 与它们所连接的碳原子一起形成 $C_3$ - $C_6$ 碳环；

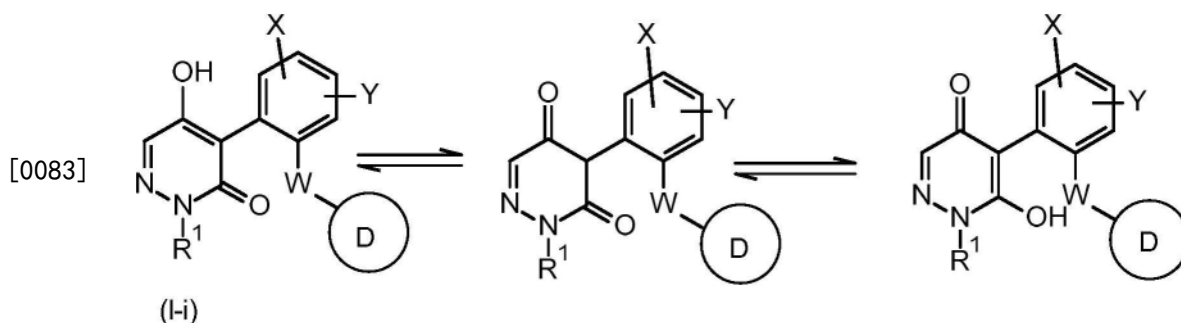
[0078]  $R^{11}$ 和 $R^{13}$ 各自独立地是氢、卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、或 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基；

[0079] 其前提是当 $R^{11}$ 或 $R^{13}$ 之一是卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基或 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基时，另一个是氢。

[0080] 具有式(I)的化合物可以含有不对称中心并且可以作为单一对映异构体、以任何比例的对映异构体对而存在，或其中存在多于一个不对称中心，含有所有可能比率的非对映异构体。典型地，与其他可能性相比，所述对映异构体之一具有增强的生物活性。

[0081] 类似地，在存在双取代烯烃的情况下，这些可以以E或Z形式或作为任何比例的二者的混合物而存在。

[0082] 此外，具有式(I)的化合物可以与替代的互变异构形式处于平衡。例如，具有式(I-i)的化合物，即，具有式(I)的化合物(其中 $R^2$ 是氢并且G是氢)，可以被绘为至少三种互变异构形式：



[0084] 应当领会的是，所有互变异构形式(单一互变异构体或其混合物)、外消旋混合物和单一异构体被包括在本发明的范围内。

[0085] 每个烷基部分单独或者作为较大基团(如烷氧基、烷硫基、烷氧基羰基、烷基羰基、烷氨基羰基或二烷氨基羰基等)的一部分可以是直链或支链的。典型地，所述烷基是例如甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基、叔丁基、正戊基、新戊基、或正己基。烷基通常是 $C_1$ - $C_6$ 烷基(除了在已经更狭窄地定义时)，但优选地是 $C_1$ - $C_4$ 烷基或 $C_1$ - $C_3$ 烷基，并且更优选地是 $C_1$ - $C_2$ 烷基(如甲基)。

[0086] 烯基与炔基部分可以处于直链或支链的形式，并且这些烯基部分适当时可以是具有(E)-或(Z)-构型。烯基或炔基部分典型地是 $C_2$ - $C_4$ 烯基或 $C_2$ - $C_4$ 炔基，更确切地说是乙烯基、烯丙基、乙炔基、炔丙基或丙-1-炔基。烯基与炔基部分能以任何组合包含一个或多个双和/或三键；但是优选地仅包含一个双键(对于烯基)或仅包含一个三键(对于炔基)。

[0087] 优选地，术语环烷基是指环丙基、环丁基、环戊基或环己基。

[0088] 在本说明书的背景下，术语“芳基”优选地意指苯基。如本文所用，术语“杂芳基”意指包含至少一个环杂原子并且由单环组成的芳香族环体系。优选地，单环将包含1、2或3个

独立地选自氮、氧以及硫的环杂原子。典型地，“杂芳基”是呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、1,2,3-三嗪基、1,2,4-三嗪基、或1,3,5-三嗪基。

[0089] 杂环基以及杂环(单独的或作为更大基团(例如杂环基-烷基-)的一部分)是包含至少一个杂原子的环体系并且可以是处于单环或双环形式。优选地,杂环基将包含最多达两个杂原子,这些杂原子将优选地选自氮、氧以及硫。杂环基团的实例包括氧杂环丁烷基、硫杂环丁烷基、氮杂环丁烷基以及7-氧杂-双环[2.2.1]庚-2-基。包含单个氧原子作为杂原子的杂环基是最优选的。所述杂环基优选地是3至8元、更优选地是3至6元单环,并且可以是完全饱和或部分饱和的。

[0090] 卤素(或卤代)涵盖了氟、氯、溴或碘。所述卤素对应地应用于其他定义背景下的卤素,如卤代烷基或卤代苯基。

[0091] 具有从1至6个碳原子链长的卤代烷基是,例如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、2,2,2-三氟乙基、2-氟乙基、2-氯乙基、五氟乙基、1,1-二氟-2,2,2-三氯乙基、2,2,3,3-四氟乙基和2,2,2-三氯乙基、七氟正丙基以及全氟正己基。

[0092] 烷氧基优选地具有从1至6个碳原子的链长。烷氧基是,例如甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、异丁氧基、仲丁氧基或叔丁氧基或戊氧基或己氧基异构体,优选地甲氧基和乙氧基。还应当理解的是,两个烷氧基取代基可以存在于相同碳原子上。

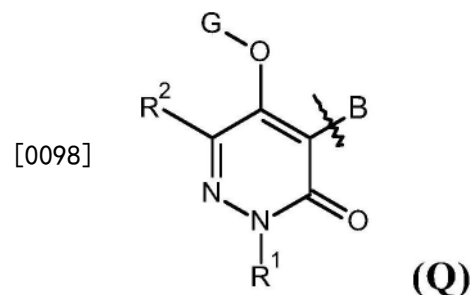
[0093] 卤代烷氧基是,例如氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基、1,1,2,2-四氟乙氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2,2-二氟乙氧基或2,2,2-三氯乙氧基,优选地是二氟甲氧基、2-氯乙氧基或三氟甲氧基。

[0094]  $C_1-C_6$ 烷基-S-(烷基硫基)是,例如甲硫基、乙硫基、丙硫基、异丙硫基、正丁硫基、异丁硫基、仲丁硫基或叔丁硫基,优选地是甲硫基或乙硫基。

[0095]  $C_1-C_6$ 烷基-S(O)-(烷基亚磺酰基)是,例如,甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、丙基亚磺酰基、异丙基亚磺酰基、正丁基亚磺酰基、异丁基亚磺酰基、仲丁基亚磺酰基或叔丁基亚磺酰基,优选地是甲基亚磺酰基或乙基亚磺酰基。

[0096]  $C_1-C_6$ 烷基-S(O)<sub>2</sub>-(烷基磺酰基)是,例如,甲基磺酰基、乙基磺酰基、丙基磺酰基、异丙基磺酰基、正丁基磺酰基、异丁基磺酰基、仲丁基磺酰基或叔丁基磺酰基,优选地是甲基磺酰基或乙基磺酰基。

[0097] 基团Q



在本文中被称为哒嗪二酮/哒嗪酮部分,其中B表示与分

子的剩余部分(即,与任选地取代的苯基-W-D部分)的附接点。

[0099] 本发明还包括农艺学上可接受的盐,具有式(I)的化合物可以与胺(例如氨、二甲胺和三乙胺)、碱金属和碱土金属碱或季铵盐碱形成这些盐。在用作成盐物的碱金属和碱土金属氢氧化物、氧化物、醇化物以及碳酸氢盐和碳酸盐之中,强调的是锂、钠、钾、镁和钙的氢氧化物、醇化物、氧化物以及碳酸盐,但尤其是钠、镁和钙的那些。还可以使用对应的三甲基铊盐。根据本发明的具有式(I)的化合物还包括在盐形成期间可以形成的水合物。

[0100]  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{5a}$ 、 $R^6$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$ 、 $R^{16}$ 、W、D、Dp、G、X、Y和m的优选值是如以下列出的,并且根据本发明的具有式(I)的化合物可以包括所述值的任何组合。技术人员将理解,用于任何指定组的实施例的值可以与用于任何其他组的实施例的值组合,其中此类组合不相互排斥。

[0101] 优选地, $R^1$ 选自由以下组成的组:甲基、乙基、丙基(具体地是正丙基或环丙基)、炔丙基或 $C_1$ 卤代烷基。更优选地, $R^1$ 是甲基、乙基、环丙基、炔丙基或 $C_1$ 氟烷基。还更优选地, $R^1$ 是甲基、乙基、环丙基或炔丙基。最优选地, $R^1$ 是甲基。

[0102] 优选地, $R^2$ 选自由以下组成的组:氢、卤素、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基- $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 卤代烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基和 $C_2$ - $C_6$ 卤代炔基。更优选地, $R^2$ 选自由以下组成的组:氯、氟、甲基、乙基、环丙基、三氟甲基和甲氧基甲基;还更优选地,氯、环丙基、三氟甲基或甲基;最优选地,氯或甲基。在本发明的一组实施例中, $R^2$ 是氢。在另外一组实施例中, $R^2$ 是环丙基;在第三组实施例中, $R^2$ 是甲基,在第四组实施例中, $R^2$ 是三氟甲基,并且在第五组实施例中, $R^2$ 是氯。

[0103] 如本文所述,G可以是氢或-C(O)- $R^3$ ,并且 $R^3$ 选自由以下组成的组: $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 烷基-S-、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基、-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>以及任选地被一个或多个R<sup>6</sup>取代的苯基。

[0104] 如本文所定义的, $R^4$ 和 $R^5$ 独立地选自由以下组成的组:氢、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基和 $C_3$ - $C_6$ 环烷基,或者它们可以一起形成吗啉基环。在取代基G(以及因此还有 $R^3$ )的情况下, $R^4$ 和 $R^5$ 优选地各自独立地选自由甲基、乙基、丙基、甲氧基、乙氧基和丙氧基组成的组并且可以分别称为 $R^{34}$ 和 $R^{35}$ 。在其他取代基(例如 $R^2$ 、 $R^8$ )的情况下, $R^4$ 和 $R^5$ 优选地各自独立地是氢、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基、或 $C_3$ - $C_6$ 环烷基,并且可以分别被称为 $R^{84}$ 和 $R^{85}$ 。在多于一个 $R^4$ 被包含在较大的部分中时,例如在基团-NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>中,技术人员将理解,每个 $R^4$ 是独立的,并且因此在这样的部分中,两个 $R^4$ 基团可以相同或它们可以彼此不同。

[0105]  $R^6$ 选自由以下组成的组:卤素、氰基、硝基、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 烷氧基以及 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基。优选地, $R^6$ 选自由以下组成的组:卤素、 $C_1$ - $C_3$ 烷基以及 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基。

[0106] 优选地, $R^3$ 是 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_2$ - $C_3$ 烯基、 $C_2$ - $C_3$ 炔基、- $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>(其中 $R^4$ 和 $R^5$ 一起形成吗啉基环)、或苯基。更优选地, $R^3$ 是异丙基、叔丁基、甲基、乙基、炔丙基、甲氧基、乙氧基或叔丁氧基。更优选地, $R^3$ 是异丙基、叔丁基、甲基、乙基、炔丙基或甲氧基。

[0107] 在一组实施例中,G是氢或-C(O)- $R^3$ ,其中 $R^3$ 是 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_2$ - $C_3$ 烯基、 $C_2$ - $C_3$ 炔基或- $C_1$ - $C_4$ 烷氧基。在另外一组实施例中,G是氢或-C(O)- $R^3$ ,其中 $R^3$ 是异丙基、叔丁基、甲基、乙基、炔丙基或甲氧基。然而,特别优选的是,G是氢、或-C(O)- $R^3$ ,其中 $R^3$ 是异丙基。

[0108] 在Y是环丙基时,X优选地是氢、环丙基、卤素、或 $C_1$ 卤代烷基,更优选地是氢、氟、氯、溴、或 $C_1$ 氟烷基并且还更优选地是氢、氟、氯或三氟甲基。最优选地,当Y是环丙基时,X是

氟。在一组实施例中,优选的是,相对于哒嗪酮/哒嗪二酮部分(基团Q),X是在邻位(6位)。特别优选的是,X是氟、氯或C<sub>1</sub>-卤代烷基(特别是C<sub>1</sub>氟烷基)并且相对于哒嗪酮/哒嗪二酮部分(基团Q)是在邻位(6位)。最优选地,X是氟并且相对于哒嗪酮/哒嗪二酮部分(基团Q)是在邻位(6位)。

[0109] 在X是环丙基时,Y优选地是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、环丙基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基或卤素,并且更优选地在此类实施例中Y是氢、氯、氟、或溴。最优选地,当X是环丙基时,Y是氯。

[0110] 在一组实施例中,优选的是相对于-W-D部分,Y是在邻位(3位)。在另外一组实施例中,相对于哒嗪酮/哒嗪二酮部分(基团Q),Y是在对位。

[0111] 特别优选的是,相对于-W-D部分,Y是在邻位(3位),并且是卤素,特别是氯或氟;更优选氯。

[0112] 如本文所述,D是经取代或未经取代的苯基环(D<sub>p</sub>)或是包含1、2或3个独立地选自氧、氮和硫的杂原子的经取代或未经取代的5或6元单环杂芳基环,并且其中当D是经取代的杂芳基环或经取代的苯基环时,其在至少一个环碳原子上被R<sup>8</sup>取代和/或在杂芳基环的情况下在环氮原子上被R<sup>9</sup>取代。当D是经取代或未经取代的5或6元单环杂芳基环时,它优选地是经取代(如本文所述的)或未经取代的咪唑基、噻吩基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、吡啶基、吡啶酮基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、1,2,3-三嗪基、1,2,4-三嗪基或1,3,5-三嗪基环。

[0113] 在此类实施例中,D优选地是经取代(如本文所述的)或未经取代的吡啶基、吡唑基、噻唑基、嘧啶基、噻吩基、三唑基或噁二唑基环,并且更优选吡啶基环。

[0114] 在一组实施例中,D是经取代(如本文所述的)或未经取代的吡唑基、咪唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、吡啶基、吡啶酮基、嘧啶基、哒嗪基或吡嗪基环。

[0115] 在另外一组此类实施例中,D是经取代(如本文所述的)或未经取代的噁唑基、噻唑基或吡啶基环。在某些实施例,D是经取代或未经取代的吡啶基环、或经取代或未经取代的噻唑基环。

[0116] D被R<sup>8</sup>取代将取决于在X位和/或Y位处存在或不存在环丙基。然而,一般来说,在D是经取代的5或6元杂芳基环时,它优选地被1或2个R<sup>8</sup>和/或1个R<sup>9</sup>、更优选被1或2个R<sup>8</sup>取代。在D是5元经取代的杂芳基环时,它最优选地被1个R<sup>8</sup>取代。在D是经取代的苯基环时,它优选地被1或2个R<sup>8</sup>、更优选被1个R<sup>8</sup>取代。

[0117] 在X和Y中的至少一个是环丙基且D被取代时,每个R<sup>8</sup>可以独立地选自氢、氧、羟基、卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>羟基烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基羰基、-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、-O-S(O)<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、-NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-C(S)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NHC(O)C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-C(O)OH、-C(O)OC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、-C(O)NHS-(O)<sub>2</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、-C(O)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基(C<sub>1</sub>-

C<sub>6</sub>烷基)氨基-、-NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>5</sup>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基磺酰基氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基磺酰基氨基-、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、羟基氨基-、羟基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、或选自自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个R<sup>16</sup>取代;

[0118] m是0、1或2的整数(优选0或2);并且每个R<sup>9</sup>独立地是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>羟基烷基-、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基-、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基-、或选自自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个R<sup>16</sup>取代;

[0119] 每个R<sup>16</sup>独立地是卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基。

[0120] 在X和Y二者均不是环苯基且D是苯基环时,D将被至少一个选自自由以下组成的组的R<sup>8</sup>取代:C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基-、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基羰基-、-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基-、-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-、-O-S(O)<sub>2</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基-、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基-、-NR<sup>4a</sup>R<sup>5a</sup>、-C(S)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NHC(O)C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-C(O)OH、-C(O)OC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-、-C(O)NHS-(O)<sub>2</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-、-C(O)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>5</sup>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基磺酰基氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基磺酰基氨基-、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、羟基氨基-、羟基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、或选自自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个R<sup>16</sup>取代;其中m、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>和R<sup>16</sup>是如本文所定义的。

[0121] 如本文所定义的,在其中X和Y二者均不是环丙基的情况下,R<sup>4a</sup>和R<sup>5a</sup>各自独立地选自自由以下组成的组:C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基,或者R<sup>4</sup>和R<sup>5</sup>一起可以形成吗啉基环。

[0122] 任何另外的R<sup>8</sup>取代基可以选自自由以下组成的组:氧、羟基、卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>卤代炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>羟基烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基-、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基羰基-、-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基-、-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-、-O-S(O)<sub>2</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基-、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基-、NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-C(S)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NHC(O)C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-C(O)OH、-C(O)OC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-、-C(O)NHS-(O)<sub>2</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-、-C(O)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>5</sup>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、-NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>5</sup>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基磺酰基氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基磺酰基氨基-、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、羟基氨基-、羟基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基氨基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基、

$C_1-C_6$ 卤代烷氧基氨基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基、或选自自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个 $R^{16}$ 取代;其中 $m$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 和 $R^{16}$ 是如本文所定义的。

[0123] 在X和Y二者均不是环苯基且D是单环杂芳基环时,D将在环碳上被至少一个选自自由以下组成的组的 $R^8$ 取代: $C_1-C_6$ 卤代烷基羰基-、 $C_3-C_6$ 环烷基羰基-、 $-S(O)_m-C_1-C_6$ 卤代烷基-、 $-S(O)_m-C_3-C_6$ 环烷基-、 $-O-S(O)_2C_1-C_3$ 烷基-、 $-C_1-C_3$ 烷基- $-S(O)_m-C_1-C_6$ 烷基-、 $-C_1-C_3$ 烷基- $-S(O)_m-C_1-C_6$ 卤代烷基-、 $-C_1-C_3$ 烷基- $-S(O)_m-C_3-C_6$ 环烷基-、氰基- $C_1-C_6$ -烷基-、 $-NR^{4a}R^{5a}$ 、 $-C(S)NR^4R^5$ 、 $-S(O)_2NHC(O)C_1-C_3$ 烷基-、 $-S(O)_2NR^4R^5$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OC_1-C_6$ 烷基-、 $-C(O)NHS-(O)_2C_1-C_6$ 烷基-、 $-C(O)NR^4R^5$ 、 $-NR^4C(O)NR^4R^5$ 、 $C_1-C_6$ 烷基羰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基羰基氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基羰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基氨基-、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基磺酰基氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基磺酰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_3-C_6$ 环烷基磺酰基氨基-、 $C_3-C_6$ 环烷基磺酰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、羟基氨基-、羟基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 烷氧基氨基-、 $C_1-C_6$ 烷氧基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、以及选自自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个 $R^{16}$ 取代;和/或D将在环氮上被至少一个选自自由以下组成的组的 $R^9$ 取代: $C_5-C_6$ 烷基-、 $C_5-C_6$ 卤代烷基-、 $C_3-C_6$ -环烷基-、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_3$ 烷基-、 $C_3$ 烷氧基- $C_1-C_2$ 烷基-、 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基-、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基-、 $C_1-C_6$ 羟基烷基-、 $-C_1-C_3$ 烷基- $-S(O)_m-C_1-C_6$ 烷基-、 $-C_1-C_3$ 烷基- $-S(O)_m-C_1-C_6$ 卤代烷基-、 $-C_1-C_3$ 烷基- $-S(O)_m-C_3-C_6$ 环烷基-、氰基- $C_1-C_6$ -烷基-、以及选自自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个 $R^{16}$ 取代;其中 $m$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^{4a}$ 、 $R^{5a}$ 和 $R^{16}$ 是如本文所定义的。

[0124] 在其中X和Y二者均不是环丙基的此类实施例中,任何另外的环碳 $R^8$ 取代基可以选自自由以下组成的组:氧、羟基、卤素、氰基、 $C_1-C_6$ 烷基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基-、 $C_3-C_6$ -环烷基-、 $C_1-C_6$ 烷氧基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基-、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基-、 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基-、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基-、 $C_2-C_6$ 烯基-、 $C_2-C_6$ 卤代烯基-、 $C_2-C_6$ 炔基-、 $C_2-C_6$ 卤代炔基-、 $C_1-C_6$ 羟基烷基-、 $C_1-C_6$ 烷基羰基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基羰基-、 $C_3-C_6$ 环烷基羰基-、 $-S(O)_m-C_1-C_6$ 卤代烷基-、 $-S(O)_m-C_3-C_6$ 环烷基-、 $-O-S(O)_2C_1-C_3$ 烷基-、 $-C_1-C_3$ 烷基- $-S(O)_m-C_1-C_6$ 烷基-、 $-C_1-C_3$ 烷基- $-S(O)_m-C_1-C_6$ 卤代烷基-、 $-C_1-C_3$ 烷基- $-S(O)_m-C_3-C_6$ 环烷基-、氰基- $C_1-C_6$ -烷基-、 $-NR^4R^5$ 、 $-C(S)NR^4R^5$ 、 $-S(O)_2NHC(O)C_1-C_3$ 烷基-、 $-S(O)_2NR^4R^5$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OC_1-C_6$ 烷基-、 $-C(O)NHS-(O)_2C_1-C_6$ 烷基-、 $-C(O)NR^4R^5$ 、 $-NR^4C(O)NR^4R^5$ 、 $C_1-C_6$ 烷基羰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基羰基氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基羰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基氨基-、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基磺酰基氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基磺酰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_3-C_6$ 环烷基磺酰基氨基-、 $C_3-C_6$ 环烷基磺酰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、羟基氨基-、羟基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 烷氧基氨基-、 $C_1-C_6$ 烷氧基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、或选自自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个 $R^{16}$ 取代;其中 $m$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 和 $R^{16}$ 是如本文所定义的,和/或任何另外的环氮 $R^9$ 取代基可以选自自由以下组成的组: $C_1-C_6$ 烷基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基-、 $C_3-C_6$ -环烷基-、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基-、 $C_1-C_3$ 卤代烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基-、 $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷氧基- $C_1-C_3$ 烷基-、 $C_1-C_6$ 羟基烷基-、 $-C_1-C_3$ 烷基- $-S(O)_m-C_1-C_6$ 烷基-、 $-C_1-C_3$ 烷基- $-S(O)_m-C_1-C_6$ 卤代烷基-、 $-C_1-C_3$ 烷基- $-S(O)_m-C_3-C_6$ 环烷基-、氰基- $C_1-C_6$ -烷基-、以及选自自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环

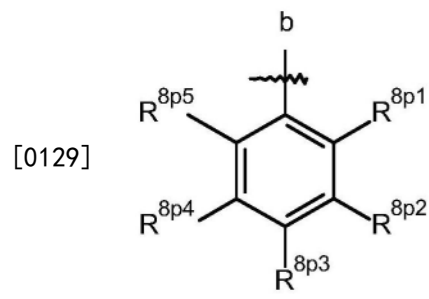
组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个 $R^{16}$ 取代;其中 $m$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 和 $R^{16}$ 是如本文所定义的。

[0125] 在其中X和Y中的至少一个是环丙基的实施例中,每个 $R^8$ 优选独立地是氧代(oxo)、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基、卤素、氰基、氨基、-NHC(O)CH<sub>3</sub>、羟基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、或 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基。更优选地,每个 $R^8$ 独立地是氧代、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基、卤素、氰基、羟基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基或 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基,最优选地,每个 $R^8$ 独立地是卤素、或 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基。

[0126] 在其中X和Y中的至少一个是环丙基的实施例中,每个 $R^9$ 优选独立地是 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 卤代烷基、羟基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、或 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基。

[0127] 在其中X和Y中的至少一个是环丙基且D是如以上所述的经取代或未经取代的5或6元单环杂芳基环的特定实施例中,D选自由以下组成的组:4-氯-3-吡啶基、4-三氟甲基吡啶基、3-吡啶基、和2-氯-噁唑-5-基、2-氯-3-吡啶基、3-氯-4-吡啶基、1-甲基-3-(三氟甲基)-吡啶-4-基、噁唑-2-基、噁唑-5-基、嘧啶-5-基、4-(叔丁氧基)苯基、2-氯-4-吡啶基、2-甲基-4-吡啶基、2-三氟甲基-4-吡啶基、4-吡啶基、2-氨基-4-吡啶基、噁吩-3-基、1-甲基-吡啶-4-基、2-甲基-三唑-4-基、5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基、5-甲基-3-吡啶基、5-甲基-2-吡啶基、6-甲基-2-吡啶基、3-甲基-2-吡啶基、6-氯-3-吡啶基、3-三氟甲基-3-吡啶基、4-甲基-2-吡啶基、2-乙酰氨基噁唑-5-基、2-氟-4-吡啶基、以及2-三氟甲基-3-吡啶基。在这些实施例的子组中,D选自由以下组成的组:4-氯-3-吡啶基、4-三氟甲基吡啶基、3-吡啶基、和2-氯-噁唑-5-基、2-氯-3-吡啶基、3-氯-4-吡啶基、1-甲基-3-(三氟甲基)-吡啶-4-基、噁唑-2-基、噁唑-5-基、嘧啶-5-基、4-(叔丁氧基)苯基、2-氯-4-吡啶基、2-甲基-4-吡啶基、2-三氟甲基-4-吡啶基、4-吡啶基、噁吩-3-基、5-甲基-3-吡啶基、5-甲基-2-吡啶基、6-甲基-2-吡啶基、3-三氟甲基-3-吡啶基、2-氟-4-吡啶基、以及2-三氟甲基-3-吡啶基。在这些实施例的另外的子组中,D选自由以下组成的组:4-氯-3-吡啶基、4-三氟甲基吡啶基、3-吡啶基、2-氟-4-吡啶基和2-氯-噁唑-5-基(优选2-氟-4-吡啶基)。

[0128] 在D是苯基环 $D_p$ 且被取代时,它可以被1至5个 $R^8$ 取代并且可以因此由以下结构表示:



其中至少一个 $R^{8p1}$ 、 $R^{8p2}$ 、 $R^{8p3}$ 、 $R^{8p4}$ 和 $R^{8p5}$ 不是氢。技

术人员将理解,如果 $R^{8p1}$ 、 $R^{8p2}$ 、 $R^{8p3}$ 、 $R^{8p4}$ 和 $R^{8p5}$ 中的至少一个不是氢,则苯基环上的任何剩余位置可以是未经取代的,或可替代地,携带另外的 $R^8$ 取代基,其在苯基环上的位置由上标 $p$ 号表示。当 $D_p$ 是未经取代的时, $R^{8p1}$ 、 $R^{8p2}$ 、 $R^{8p3}$ 、 $R^{8p4}$ 和 $R^{8p5}$ 将不存在,

[0130] 如上所述,D被 $R^8$ 取代将取决于在X位和/或Y位处存在或不存在环丙基。因此,在 $D_p$ 中,在X和Y中的至少一个是环丙基时,优选的是 $R^{8p1}$ 、 $R^{8p2}$ 、 $R^{8p3}$ 、 $R^{8p4}$ 和 $R^{8p5}$ 中的一个或多个独立地选自由氰基、氨基、 $C_1$ - $C_3$ 二烷基氨基、羟基、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基和卤素组成的组,并且 $b$ 是与分子的剩余部分的附接点。

[0131] 在一组此类实施例中,  $R^{8p1}$ 、 $R^{8p2}$ 、 $R^{8p3}$ 、 $R^{8p4}$ 和 $R^{8p5}$ 中的一个或多个各自独立地选自氰基、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基、或卤素。优选地,  $R^{8p1}$ 、 $R^{8p2}$ 、 $R^{8p3}$ 、 $R^{8p4}$ 和 $R^{8p5}$ 中的一个或多个独立地选自氰基、卤素(特别是氯或氟)、甲基、甲氧基、和三氟甲基。

[0132] 在又另一组实施例中,  $R^{8p1}$ 、 $R^{8p2}$ 、 $R^{8p4}$ 和 $R^{8p5}$ 中的每一个不存在, 并且 $R^{8p3}$ 是氰基、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基、或卤素。优选地, 在此组实施例中,  $R^{8p3}$ 是卤素, 更优选地是氯。

[0133] 在还另外一组实施例中,  $R^{8p1}$ 、 $R^{8p4}$ 和 $R^{8p5}$ 中的每一个不存在, 并且 $R^{8p2}$ 和 $R^{8p3}$ 各自独立地是氰基、 $C_1$ - $C_3$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷基、 $C_1$ - $C_3$ 卤代烷氧基、或卤素。在此组实施例中, 特别优选的是,  $R^{8p2}$ 和 $R^{8p3}$ 各自独立地是卤素, 并且更优选地,  $R^{8p2}$ 和 $R^{8p3}$ 都是氯。

[0134] 在一组特别优选的实施例中, 在X和/或Y中的至少一个是环丙基时, D是未经取代的苯基环。

[0135] 在另外的实施例中, 一组特别优选的实施例中, 在X和/或Y中的至少一个是环丙基时, D选自由以下组成的组: 4-氯-苯基、4-三氟甲基-苯基、4-氰基苯基、4-氟-苯基、3,4-二-氟-苯基、2-三氟甲基-苯基和4-甲苯基。

[0136] W充当连接基部分, 将环D连接到分子的剩余部分(即, 连接到苯基-哒嗪酮/苯基-哒嗪二酮部分)。具有式(I)的化合物(其中连接基是W1)是除草剂, 而具有式(I)的化合物(其中连接基是W2)可以不仅是除草剂, 还是可用于生产携带W1连接基的具有式(I)的化合物的中间体。因此, 在一组实施例中, W是W1, 而在第二组实施例中, W是W2。在第三组实施例中, W是 $-C\equiv C-$ 。

[0137] 优选地,  $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 各自独立地选自氢或 $C_1$ - $C_3$ 烷基。在一组实施例中,  $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 都是氢。

[0138] 优选地,  $R^{14}$ 和 $R^{15}$ 各自独立地选自氢或 $C_1$ - $C_3$ 烷基。在一组实施例中,  $R^{14}$ 和 $R^{15}$ 都是氢。

[0139] W的具体实例包括 $-CH_2-CH_2-$ 、和 $-CH=CH-$ 、顺式 $\begin{matrix} \text{H} \\ | \\ \text{H}_2\text{C}-\text{C}-\text{CH} \\ | \\ \text{H} \end{matrix}$ 和反式 $\begin{matrix} \text{H} \\ | \\ \text{H}_2\text{C}-\text{C}-\text{CH} \\ | \\ \text{H} \end{matrix}$ 和 $-C\equiv C-$ 。

在更优选的实施例中, W是 $-CH_2-CH_2-$ 、或 $-CH=CH-$ (特别是(E)- $-CH=CH-$ ), 还更优选 $-CH_2-CH_2-$ 。

[0140] 在一组优选的实施例(其中X和Y二者均不是环丙基)中, 在具有式(I)的化合物中:

[0141]  $R^1$ 是甲基、乙基、环丙基、炔丙基或 $C_1$ 氟烷基;

[0142]  $R^2$ 是氯、环丙基、三氟甲基或甲基;

[0143] G是氢或 $-C(O)-R^3$ , 其中 $R^3$ 是异丙基、叔丁基、甲基、乙基、炔丙基、甲氧基、乙氧基、或叔丁氧基;

[0144] X是氟、氯或 $C_1$ -卤代烷基并且相对于哒嗪酮/哒嗪-二酮部分是在邻位;

[0145] Y是氢、氯、氟或溴并且相对于 $-W-D$ 部分是在邻位;

[0146] D是被至少一个选自由以下组成的组的 $R^8$ 取代的苯基环: $C_1$ - $C_6$ 卤代烷基羰基-、 $C_3$ - $C_6$ 环烷基羰基-、 $-S(O)_m-C_1$ - $C_6$ 卤代烷基-、 $-S(O)_m-C_3$ - $C_6$ 环烷基-、 $-O-S(O)_2C_1$ - $C_3$ 烷基-、 $-C_1$ - $C_3$ 烷基- $S(O)_m-C_1$ - $C_6$ 烷基-、 $-C_1$ - $C_3$ 烷基- $S(O)_m-C_1$ - $C_6$ 卤代烷基-、 $-C_1$ - $C_3$ 烷基- $S(O)_m-C_3$ - $C_6$ 环烷基-、氰

基- $C_1-C_6$ -烷基-、 $-NR^{4a}R^{5a}$ 、 $-C(S)NR^4R^5$ 、 $-S(O)_2NHC(O)C_1-C_3$ 烷基、 $-S(O)_2NR^4R^5$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OC_1-C_6$ 烷基、 $-C(O)NHS-(O)_2C_1-C_6$ 烷基、 $-C(O)NR^4R^5$ 、 $-NR^4C(O)NR^4R^5$ 、 $C_1-C_6$ 烷基羰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基羰基氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基羰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基氨基-、 $C_1-C_6$ 烷基磺酰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基磺酰基氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基磺酰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_3-C_6$ 环烷基磺酰基氨基-、 $C_3-C_6$ 环烷基磺酰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、羟基氨基-、羟基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基、 $C_1-C_6$ 烷氧基氨基、 $C_1-C_6$ 烷氧基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基、 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基氨基和 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基、或选自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个 $R^{16}$ 取代;并且

[0147] 任何另外的 $R^8$ 取代基可以选自由以下组成的组:羟基、卤素、氰基、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_3-C_6$ -环烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基、 $C_2-C_6$ 烯基和 $C_2-C_6$ 炔基;

[0148]  $R^4$ 和 $R^5$ 各自独立地是氢、 $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基或 $C_3-C_6$ 环烷基;

[0149]  $m$ 是0、1或2的整数(优选0或2);

[0150]  $R^{4a}$ 和 $R^{5a}$ 各自独立地选自由以下组成的组: $C_1-C_6$ 烷氧基和 $C_3-C_6$ 环烷基,或者 $R^{4a}$ 和 $R^{5a}$ 一起可以形成吗啉基环;并且,

[0151] 每个 $R^{16}$ 独立地是卤素、氰基、 $C_1-C_6$ 烷基、 $C_1-C_6$ 卤代烷基、 $C_1-C_6$ 烷氧基或 $C_1-C_6$ 卤代烷氧基;

[0152]  $W$ 是 $W1$ ;并且

[0153]  $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 都是氢。

[0154] 在一组更优选的实施例(其中 $X$ 和 $Y$ 二者均不是环丙基)中,在具有式(I)的化合物中:

[0155]  $R^1$ 是甲基;

[0156]  $R^2$ 是甲基;

[0157]  $G$ 是氢或 $-C(O)-R^3$ ,其中 $R^3$ 是异丙基、叔丁基、甲基、乙基、炔丙基、甲氧基、乙氧基、或叔丁氧基;

[0158]  $X$ 是氟并且相对于哒嗪酮/哒嗪-二酮部分是在邻位;

[0159]  $Y$ 是氯并且相对于 $-W-D$ 部分是在邻位;

[0160]  $D$ 是被1或2个 $R^8$ 取代的苯基环,其中至少一个 $R^8$ 选自由以下组成的组: $C_1-C_6$ 卤代烷基羰基-、 $C_3-C_6$ 环烷基羰基-、 $-S(O)_m-C_1-C_6$ 卤代烷基、 $-S(O)_m-C_3-C_6$ 环烷基、 $-O-S(O)_2C_1-C_3$ 烷基、 $-C_1-C_3$ 烷基- $S(O)_m-C_1-C_6$ 烷基、 $-C_1-C_3$ 烷基- $S(O)_m-C_1-C_6$ 卤代烷基、 $-C_1-C_3$ 烷基- $S(O)_m-C_3-C_6$ 环烷基、 $-S(O)_2NHC(O)C_1-C_3$ 烷基、 $-S(O)_2NR^4R^5$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OC_1-C_6$ 烷基、 $-C(O)NHS-(O)_2C_1-C_6$ 烷基、 $-C(O)NR^4R^5$ 、 $-NR^4C(O)NR^4R^5$ 、 $C_1-C_6$ 烷基羰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、 $C_1-C_6$ 卤代烷基羰基氨基-和 $C_1-C_6$ 卤代烷基羰基( $C_1-C_6$ 烷基)氨基-、或选自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个 $R^{16}$ 取代;并且

[0161] 任何另外的 $R^8$ 取代基可以选自由以下组成的组:卤素、 $C_1-C_6$ 烷基和 $C_1-C_6$ 卤代烷基;

[0162]  $R^4$ 和 $R^5$ 各自独立地是氢、 $C_1-C_3$ 烷基、 $C_1-C_3$ 烷氧基或 $C_3-C_6$ 环烷基;

[0163]  $m$ 是0或2(优选0);

[0164] 每个 $R^{16}$ 独立地是卤素、氰基、 $C_1-C_4$ 烷基、 $C_1-C_3$ 卤代烷基或 $C_1-C_4$ 烷氧基;

[0165]  $W$ 是 $W1$ ;并且

[0166]  $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 都是氢。

[0167] 在一组甚至更优选的实施例(其中X和Y二者均不是环丙基)中,在具有式(I)的化合物中:

[0168]  $R^1$ 是甲基;

[0169]  $R^2$ 是甲基;

[0170] G是氢或 $-C(O)-R^3$ ,其中 $R^3$ 是异丙基、叔丁基、甲基、乙基、炔丙基或甲氧基;

[0171] X是氟并且相对于哒嗪酮/哒嗪-二酮部分是在邻位;

[0172] Y是氯并且相对于-W-D部分是在邻位;

[0173] D是被一个选自由以下组成的组的 $R^8$ 取代的苯基环: $-C_1-C_3$ 烷基- $S(O)_m-C_1-C_6$ 烷基、 $-S(O)_2NHC(O)C_1-C_3$ 烷基、 $-S(O)_2NR^4R^5$ 、 $-C(O)OH$ 、 $-C(O)OC_1-C_6$ 烷基和 $-C(O)NR^4R^5$ 、或选自由苯基、吗啉基、四氢呋喃基、呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、四唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、吡啶基、吡啶酮基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、1,2,3-三嗪基、1,2,4-三嗪基、或1,3,5-三嗪基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至2个 $R^{16}$ 取代;

[0174]  $R^4$ 和 $R^5$ 各自独立地是氢或 $C_1-C_3$ 烷基;

[0175] m是0或2(优选0);

[0176] 每个 $R^{16}$ 独立地是卤素或 $C_1-C_4$ 烷基(优选甲基);

[0177] W是W1;并且

[0178]  $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 都是氢。

[0179] 又在一组甚至更优选的实施例(其中X和Y二者均不是环丙基)中,在具有式(I)的化合物中:

[0180]  $R^1$ 是甲基;

[0181]  $R^2$ 是甲基;

[0182] G是氢或 $-C(O)-R^3$ ,其中 $R^3$ 是异丙基;

[0183] X是氟并且相对于哒嗪酮/哒嗪-二酮部分是在邻位;

[0184] Y是氯并且相对于-W-D部分是在邻位;

[0185] D是被一个选自由以下组成的组的 $R^8$ 取代的苯基环:甲基硫烷基甲基、异丙基硫烷基甲基、氨磺酰基、甲基氨磺酰基和氨基甲酰基、或选自由苯基、吗啉基、四氢呋喃基、呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡唑基、1,2,4-三唑基、噁唑基和噻唑基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至2个 $R^{16}$ 取代;

[0186] 每个 $R^{16}$ 是甲基;

[0187] W是W1;并且

[0188]  $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 都是氢。

[0189] 在替代组的优选的实施例(其中X和Y二者均不是环丙基)中,在具有式(I)的化合物中:

[0190]  $R^1$ 是甲基、乙基、环丙基、炔丙基或 $C_1$ 氟烷基;

[0191]  $R^2$ 是氯、环丙基、三氟甲基或甲基;

[0192] G是氢或 $-C(O)-R^3$ ,其中 $R^3$ 是异丙基、叔丁基、甲基、乙基、炔丙基、甲氧基、乙氧基、或叔丁氧基;

- [0193] X是氟、氯或C<sub>1</sub>-卤代烷基并且相对于哒嗪酮/哒嗪-二酮部分是在邻位；
- [0194] Y是氢、氯、氟或溴并且相对于-W-D部分是在邻位；
- [0195] D是含有1、2或3个独立地选自氧、氮和硫的杂原子的5或6元单环杂芳基环，其在环碳上被至少一个选自自由以下组成的组的R<sup>8</sup>取代：C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基-、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基羰基-、-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基-、-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-、-O-S(O)<sub>2</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基-、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基-、NR<sup>4a</sup>R<sup>5a</sup>、-C(S)NR<sup>4R5</sup>、-S(O)<sub>2</sub>NHC(O)C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4R5</sup>、-C(O)OH、-C(O)OC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-、-C(O)NHS-(O)<sub>2</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-、-C(O)NR<sup>4R5</sup>、-NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>5</sup>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基磺酰基氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基磺酰基氨基-、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基磺酰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、羟基氨基-、羟基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、以及选自自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系，其中所述环体系被0至5个R<sup>16</sup>取代；并且
- [0196] 任何另外的R<sup>8</sup>取代基可以选自自由以下组成的组：羟基、卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基和C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>炔基；和/或D将在环氮上被至少一个选自自由以下组成的组的R<sup>9</sup>取代：C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>3</sub>烷基-、C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>羟基烷基-、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基-、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基-、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基-、氰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基-、以及选自自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系，其中所述环体系被0至5个R<sup>16</sup>取代；
- [0197] R<sup>4</sup>和R<sup>5</sup>各自独立地是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基；
- [0198] m是0、1或2的整数(优选0或2)；
- [0199] R<sup>4a</sup>和R<sup>5a</sup>各自独立地选自自由以下组成的组：C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基，或者R<sup>4a</sup>和R<sup>5a</sup>一起可以形成吗啉基环；并且，
- [0200] 每个R<sup>16</sup>独立地是卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷氧基；
- [0201] W是W1；并且
- [0202] R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>都是氢。
- [0203] 在替代组的更优选的实施例(其中X和Y二者均不是环丙基)中，在具有式(I)的化合物中：
- [0204] R<sup>1</sup>是甲基；
- [0205] R<sup>2</sup>是甲基；
- [0206] G是氢或-C(O)-R<sup>3</sup>，其中R<sup>3</sup>是异丙基、叔丁基、甲基、乙基、炔丙基、甲氧基、乙氧基、或叔丁氧基；
- [0207] X是氟并且相对于哒嗪酮/哒嗪-二酮部分是在邻位；
- [0208] Y是氯并且相对于-W-D部分是在邻位；
- [0209] D是含有1、2或3个独立地选自氧、氮和硫的杂原子的5或6元单环杂芳基环，其在环碳上被1或2个R<sup>8</sup>取代，其中至少一个R<sup>8</sup>选自自由以下组成的组：C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基-、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环

烷基羰基-、-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、-O-S(O)<sub>2</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、-S(O)<sub>2</sub>NHC(O)C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-C(O)OH、-C(O)OC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、-C(O)NHS-(O)<sub>2</sub>C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、-C(O)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-NR<sup>4</sup>C(O)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基氨基-以及C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基羰基(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基)氨基-、或选自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个R<sup>16</sup>取代;并且

[0210] 任何另外的R<sup>8</sup>取代基可以选自由以下组成的组:卤素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基和C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基;和/或D将在环氮上被一个选自由以下组成的组的R<sup>9</sup>取代:C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>卤代烷基、-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基、以及选自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至5个R<sup>16</sup>取代;

[0211] R<sup>4</sup>和R<sup>5</sup>各自独立地是氢、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>环烷基;

[0212] m是0或2(优选0);

[0213] 每个R<sup>16</sup>独立地是卤素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>卤代烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基;

[0214] W是W1;并且

[0215] R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>都是氢。

[0216] 在替代组的甚至更优选的实施例(其中X和Y二者均不是环丙基)中,在具有式(I)的化合物中:

[0217] R<sup>1</sup>是甲基;

[0218] R<sup>2</sup>是甲基;

[0219] G是氢或-C(O)-R<sup>3</sup>,其中R<sup>3</sup>是异丙基、叔丁基、甲基、乙基、炔丙基或甲氧基;

[0220] X是氟并且相对于哒嗪酮/哒嗪-二酮部分是在邻位;

[0221] Y是氯并且相对于-W-D部分是在邻位;

[0222] D是含有1、2或3个氮原子的5或6元单环杂芳基环,其在环碳上被一个选自由以下组成的组的R<sup>8</sup>取代:-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基-S(O)<sub>m</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、-S(O)<sub>2</sub>NHC(O)C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、-S(O)<sub>2</sub>NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、-C(O)OH、-C(O)OC<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基和-C(O)NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>、或选自由苯基、吗啉基、四氢呋喃基、呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、四唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、吡啶基、吡啶酮基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、1,2,3-三嗪基、1,2,4-三嗪基、或1,3,5-三嗪基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至2个R<sup>16</sup>取代;和/或D将在环氮上被一个选自由以下组成的组的R<sup>9</sup>取代:C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-环烷基、以及选自由苯基环、5-6元杂芳基环和3-6元杂环基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至2个R<sup>16</sup>取代;

[0223] R<sup>4</sup>和R<sup>5</sup>各自独立地是氢或C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基;

[0224] m是0或2(优选0);

[0225] 每个R<sup>16</sup>独立地是卤素或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基(优选甲基);

[0226] W是W1;并且

[0227] R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>都是氢。

[0228] 又在替代组的甚至更优选的实施例(其中X和Y二者均不是环丙基)中,在具有式

(I)的化合物中:

[0229] R<sup>1</sup>是甲基;

[0230] R<sup>2</sup>是甲基;

[0231] G是氢或-C(O)-R<sup>3</sup>,其中R<sup>3</sup>是异丙基;

[0232] X是氟并且相对于哒嗪酮/哒嗪-二酮部分是在邻位;

[0233] Y是氯并且相对于-W-D部分是在邻位;

[0234] D是在环碳上被一个选自由以下组成的组的R<sup>8</sup>取代的吡唑基或吡啶基:甲基硫烷基甲基、异丙基硫烷基甲基、氨磺酰基、甲基氨磺酰基和氨基甲酰基、或选自由苯基、吗啉基、四氢呋喃基、呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡唑基、1,2,4-三唑基、噁唑基和噻唑基环组成的组的环体系,其中所述环体系被0至2个R<sup>16</sup>取代;和/或D将在环氮上被一个选自环丙基或苯基的R<sup>9</sup>取代;

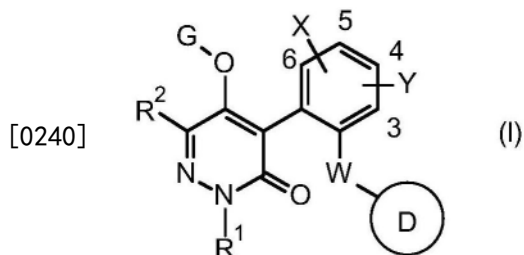
[0235] 每个R<sup>16</sup>是甲基;

[0236] W是W1;并且

[0237] R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>都是氢。

[0238] 下表A-1、A-2、A-3、A-4、B-1、B-2、B-3、B-4、C-1、C-2、C-3和C-4阐明了本发明的具有式(I)的化合物的具体实例。

[0239] 本发明的除草化合物。用于描述以下示出的式(I)的化合物中X和Y的位置的编号系统仅为清楚起见而示出。



[0241] 表A-1提供了672种具有式(I)的化合物A-1.001至A-1.672,其中G是-H,W是-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、X、Y、D是如下表1中分别对于化合物编号1.001至1.672所定义的。

[0242] 表1:R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、X、Y和D的取代基定义:

化合物编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
[0243] 1.001	-Me	-Me	6-F	3-F	4-噁唑-5-基苯基-
1.002	-Me	-Me	6-F	3-F	4-乙酰胺基苯基-
1.003	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(二甲基氨磺酰基)苯基-
1.004	-Me	-Me	6-F	3-F	4-叔丁基苯基-
1.005	-Me	-Me	6-F	3-F	4-联苯基-

[0244]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.006	-Me	-Me	6-F	3-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3- 氟-苯基-
1.007	-Me	-Me	6-F	3-F	2-氟基苯基-
1.008	-Me	-Me	6-F	3-F	3-氟基苯基-
1.009	-Me	-Me	6-F	3-F	4-氨基-3-甲基苯基-
1.010	-Me	-Me	6-F	3-F	4-甲基磺酰基苯基-
1.011	-Me	-Me	6-F	3-F	4-二甲基氨基苯基-
1.012	-Me	-Me	6-F	3-F	4-甲基氨基苯基-
1.013	-Me	-Me	6-F	3-F	4-叔丁氧基苯基-
1.014	-Me	-Me	6-F	3-F	4-氟基苯基-
1.015	-Me	-Me	6-F	3-F	4-羟基苯基-
1.016	-Me	-Me	6-F	3-F	4-环丙基苯基-
1.017	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.018	-Me	-Me	6-F	3-F	4-羧基苯基-
1.019	-Me	-Me	6-F	3-F	4-甲氧基羰基苯基-
1.020	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯 基-
1.021	-Me	-Me	6-F	3-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
1.022	-Me	-Me	6-F	3-F	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.023	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-噁唑-5-基苯基-
1.024	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-乙酰胺基苯基-
1.025	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
1.026	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-叔丁基苯基-
1.027	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-联苯基-
1.028	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3- 氟-苯基-

[0245]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.029	-Me	-Me	6-F	3-Cl	2-氟基苯基-
1.030	-Me	-Me	6-F	3-Cl	3-氟基苯基-
1.031	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
1.032	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-甲基磺酰基苯基-
1.033	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-二甲基氨基苯基-
1.034	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-甲基氨基苯基-
1.035	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-叔丁氧基苯基-
1.036	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-氟基苯基-
1.037	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-羟基苯基-
1.038	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-环丙基苯基-
1.039	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.040	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-羧基苯基-
1.041	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
1.042	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
1.043	-Me	-Me	6-F	3-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
1.044	-Me	-Me	6-F	3-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.045	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-噁唑-5-基苯基-
1.046	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-乙酰胺基苯基-
1.047	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
1.048	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-叔丁基苯基-
1.049	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-联苯基-
1.050	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
1.051	-Me	-Me	6-Cl	3-F	2-氟基苯基-
1.052	-Me	-Me	6-Cl	3-F	3-氟基苯基-

[0246]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.053	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-氨基-3-甲基苯基-
1.054	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-甲基磺酰基苯基-
1.055	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-二甲基氨基苯基-
1.056	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-甲基氨基苯基-
1.057	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-叔丁氧基苯基-
1.058	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-氟基苯基-
1.059	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-羟基苯基-
1.060	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-环丙基苯基-
1.061	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.062	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-羧基苯基-
1.063	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-甲氧基羰基苯基-
1.064	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
1.065	-Me	-Me	6-Cl	3-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
1.066	-Me	-Me	6-Cl	3-F	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.067	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-噁唑-5-基苯基-
1.068	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-乙酰胺基苯基-
1.069	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
1.070	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-叔丁基苯基-
1.071	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-联苯基-
1.072	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
1.073	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	2-氟基苯基-
1.074	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	3-氟基苯基-
1.075	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
1.076	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-甲基磺酰基苯基-

[0247]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.077	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-二甲基氨基苯基-
1.078	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-甲基氨基苯基-
1.079	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-叔丁氧基苯基-
1.080	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-氟基苯基-
1.081	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-羟基苯基-
1.082	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-环丙基苯基-
1.083	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.084	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-羧基苯基-
1.085	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
1.086	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
1.087	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
1.088	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.089	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-噁唑-5-基苯基-
1.090	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-乙酰胺基苯基-
1.091	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
1.092	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-叔丁基苯基-
1.093	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-联苯基-
1.094	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
1.095	-Me	-Cl	6-F	3-F	2-氟基苯基-
1.096	-Me	-Cl	6-F	3-F	3-氟基苯基-
1.097	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-氨基-3-甲基苯基-
1.098	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-甲基磺酰基苯基-
1.099	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-二甲基氨基苯基-
1.100	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-甲基氨基苯基-

[0248]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.101	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-叔丁氧基苯基-
1.102	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-氟基苯基-
1.103	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-羟基苯基-
1.104	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-环丙基苯基-
1.105	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.106	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-羧基苯基-
1.107	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-甲氧基羰基苯基-
1.108	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
1.109	-Me	-Cl	6-F	3-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
1.110	-Me	-Cl	6-F	3-F	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.111	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-噁唑-5-基苯基-
1.112	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-乙酰胺基苯基-
1.113	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
1.114	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-叔丁基苯基-
1.115	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-联苯基-
1.116	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
1.117	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	2-氟基苯基-
1.118	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	3-氟基苯基-
1.119	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
1.120	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-甲基磺酰基苯基-
1.121	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-二甲基氨基苯基-
1.122	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-甲基氨基苯基-
1.123	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-叔丁氧基苯基-
1.124	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-氟基苯基-

[0249]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.125	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-羟基苯基-
1.126	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-环丙基苯基-
1.127	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.128	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-羧基苯基-
1.129	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
1.130	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
1.131	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
1.132	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.133	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-噁唑-5-基苯基-
1.134	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-乙酰胺基苯基-
1.135	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
1.136	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-叔丁基苯基-
1.137	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-联苯基-
1.138	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
1.139	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	2-氟基苯基-
1.140	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	3-氟基苯基-
1.141	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-氨基-3-甲基苯基-
1.142	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-甲基磺酰基苯基-
1.143	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-二甲基氨基苯基-
1.144	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-甲基氨基苯基-
1.145	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-叔丁氧基苯基-
1.146	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-氟基苯基-
1.147	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-羟基苯基-
1.148	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-环丙基苯基-

[0250]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.149	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.150	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-羧基苯基-
1.151	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-甲氧基羰基苯基-
1.152	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
1.153	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
1.154	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.155	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-噁唑-5-基苯基-
1.156	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-乙酰胺基苯基-
1.157	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
1.158	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-叔丁基苯基-
1.159	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-联苯基-
1.160	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
1.161	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-氟基苯基-
1.162	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	3-氟基苯基-
1.163	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
1.164	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-甲基磺酰基苯基-
1.165	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-二甲基氨基苯基-
1.166	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-甲基氨基苯基-
1.167	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-叔丁氧基苯基-
1.168	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-氟基苯基-
1.169	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-羟基苯基-
1.170	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-环丙基苯基-
1.171	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.172	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-羧基苯基-

[0251]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.173	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
1.174	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
1.175	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
1.176	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.177	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-噁唑-5-基苯基-
1.178	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-乙酰胺基苯基-
1.179	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
1.180	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-叔丁基苯基-
1.181	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-联苯基-
1.182	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
1.183	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	2-氟基苯基-
1.184	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	3-氟基苯基-
1.185	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-氨基-3-甲基苯基-
1.186	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-甲基磺酰基苯基-
1.187	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-二甲基氨基苯基-
1.188	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-甲基氨基苯基-
1.189	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-叔丁氧基苯基-
1.190	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-氟基苯基-
1.191	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-羟基苯基-
1.192	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-环丙基苯基-
1.193	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.194	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-羧基苯基-
1.195	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-甲氧基羰基苯基-
1.196	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-

[0252]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
					基-
1.197	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
1.198	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.199	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-噁唑-5-基苯基-
1.200	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-乙酰胺基苯基-
1.201	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
1.202	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-叔丁基苯基-
1.203	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-联苯基-
1.204	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3- 氟-苯基-
1.205	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	2-氟基苯基-
1.206	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	3-氟基苯基-
1.207	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
1.208	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-甲基磺酰基苯基-
1.209	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-二甲基氨基苯基-
1.210	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-甲基氨基苯基-
1.211	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-叔丁氧基苯基-
1.212	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-氟基苯基-
1.213	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-羟基苯基-
1.214	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-环丙基苯基-
1.215	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.216	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-羧基苯基-
1.217	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
1.218	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯 基-
1.219	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-

[0253]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.220	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.221	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-噁唑-5-基苯基-
1.222	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-乙酰胺基苯基-
1.223	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
1.224	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-叔丁基苯基-
1.225	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-联苯基-
1.226	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
1.227	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	2-氟基苯基-
1.228	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	3-氟基苯基-
1.229	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-氨基-3-甲基苯基-
1.230	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-甲基磺酰基苯基-
1.231	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-二甲基氨基苯基-
1.232	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-甲基氨基苯基-
1.233	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-叔丁氧基苯基-
1.234	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-氟基苯基-
1.235	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-羟基苯基-
1.236	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-环丙基苯基-
1.237	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.238	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-羧基苯基-
1.239	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-甲氧基羰基苯基-
1.240	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
1.241	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
1.242	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.243	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-噁唑-5-基苯基-

[0254]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.244	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-乙酰胺基苯基-
1.245	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(二甲基膦酰基)苯基-
1.246	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-叔丁基苯基-
1.247	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-联苯基-
1.248	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3- 氟-苯基-
1.249	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	2-氟基苯基-
1.250	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	3-氟基苯基-
1.251	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
1.252	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-甲基膦酰基苯基-
1.253	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-二甲基氨基苯基-
1.254	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-甲基氨基苯基-
1.255	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-叔丁氧基苯基-
1.256	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-氟基苯基-
1.257	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-羟基苯基-
1.258	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-环丙基苯基-
1.259	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.260	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-羧基苯基-
1.261	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
1.262	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯 基-
1.263	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
1.264	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.265	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-噁唑-5-基苯基-
1.266	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-乙酰胺基苯基-
1.267	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(二甲基膦酰基)苯基-

[0255]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.268	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-叔丁基苯基-
1.269	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-联苯基-
1.270	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3- 氟-苯基-
1.271	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	2-氟基苯基-
1.272	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	3-氟基苯基-
1.273	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-氨基-3-甲基苯基-
1.274	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-甲基磺酰基苯基-
1.275	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-二甲基氨基苯基-
1.276	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-甲基氨基苯基-
1.277	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-叔丁氧基苯基-
1.278	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-氟基苯基-
1.279	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-羟基苯基-
1.280	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-环丙基苯基-
1.281	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.282	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-羧基苯基-
1.283	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-甲氧基羰基苯基-
1.284	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯 基-
1.285	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
1.286	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.287	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-噁唑-5-基苯基-
1.288	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-乙酰胺基苯基-
1.289	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
1.290	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-叔丁基苯基-
1.291	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-联苯基-

[0256]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.292	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3- 氟-苯基-
1.293	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	2-氟基苯基-
1.294	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	3-氟基苯基-
1.295	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
1.296	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-甲基磺酰基苯基-
1.297	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-二甲基氨基苯基-
1.298	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-甲基氨基苯基-
1.299	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-叔丁氧基苯基-
1.300	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-氟基苯基-
1.301	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-羟基苯基-
1.302	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-环丙基苯基-
1.303	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.304	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-羧基苯基-
1.305	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
1.306	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯 基-
1.307	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
1.308	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.309	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-噁唑-5-基苯基-
1.310	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-乙酰胺基苯基-
1.311	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
1.312	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-叔丁基苯基-
1.313	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-联苯基-
1.314	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3- 氟-苯基-

[0257]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.315	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	2-氟基苯基-
1.316	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	3-氟基苯基-
1.317	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-氨基-3-甲基苯基-
1.318	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-甲基磺酰基苯基-
1.319	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-二甲基氨基苯基-
1.320	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-甲基氨基苯基-
1.321	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-叔丁氧基苯基-
1.322	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-氟基苯基-
1.323	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-羟基苯基-
1.324	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-环丙基苯基-
1.325	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.326	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-羧基苯基-
1.327	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-甲氧基羰基苯基-
1.328	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
1.329	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
1.330	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.331	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-噁唑-5-基苯基-
1.332	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-乙酰胺基苯基-
1.333	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
1.334	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-叔丁基苯基-
1.335	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-联苯基-
1.336	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
1.337	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-氟基苯基-
1.338	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	3-氟基苯基-

[0258]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.339	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
1.340	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-甲基磺酰基苯基-
1.341	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-二甲基氨基苯基-
1.342	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-甲基氨基苯基-
1.343	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-叔丁氧基苯基-
1.344	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-氟基苯基-
1.345	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-羟基苯基-
1.346	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-环丙基苯基-
1.347	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-
1.348	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-羧基苯基-
1.349	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
1.350	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
1.351	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
1.352	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
1.353	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
1.354	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.355	-Me	-Me	6-F	3-F	4-吗啉代苯基-
1.356	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.357	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
1.358	-Me	-Me	6-F	3-F	4-吡唑-1-基苯基-
1.359	-Me	-Me	6-F	3-F	4-吡咯-1-基苯基-
1.360	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
1.361	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
1.362	-Me	-Me	6-F	3-F	4-噁唑-2-基苯基-
1.363	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-

[0259]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.364	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(2-噻吩基)苯基-
1.365	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
1.366	-Me	-Me	6-F	3-F	1-苯基-4-吡唑基-
1.367	-Me	-Me	6-F	3-F	1-环丙基-4-吡唑基-
1.368	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.369	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
1.370	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.371	-Me	-Me	6-F	3-F	4-氨磺酰基苯基-
1.372	-Me	-Me	6-F	3-F	4-氨基甲酰基苯基-
1.373	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
1.374	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.375	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-吗啉代苯基-
1.376	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.377	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
1.378	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
1.379	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
1.380	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-甲基四氢咪唑-2-基)苯基-
1.381	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-甲基-2-咪唑基)苯基-
1.382	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
1.383	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
1.384	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-
1.385	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
1.386	-Me	-Me	6-F	3-Cl	1-苯基-4-吡唑基-
1.387	-Me	-Me	6-F	3-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-
1.388	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.389	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-

[0260]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.390	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.391	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-氨磺酰基苯基-
1.392	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-氨基甲酰基苯基-
1.393	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
1.394	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.395	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-吗啉代苯基-
1.396	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.397	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
1.398	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-吡唑-1-基苯基-
1.399	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-吡咯-1-基苯基-
1.400	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
1.401	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
1.402	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-噁唑-2-基苯基-
1.403	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
1.404	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-噻吩基)苯基-
1.405	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
1.406	-Me	-Me	6-Cl	3-F	1-苯基-4-吡唑基-
1.407	-Me	-Me	6-Cl	3-F	1-环丙基-4-吡唑基-
1.408	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.409	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
1.410	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.411	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-氨磺酰基苯基-
1.412	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-氨基甲酰基苯基-
1.413	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
1.414	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.415	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-吗啉代苯基-

[0261]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.416	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.417	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
1.418	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
1.419	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
1.420	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
1.421	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
1.422	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
1.423	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
1.424	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-
1.425	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
1.426	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	1-苯基-4-吡唑基-
1.427	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-
1.428	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.429	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
1.430	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.431	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-氨磺酰基苯基-
1.432	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-氨基甲酰基苯基-
1.433	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
1.434	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.435	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-吗啉代苯基-
1.436	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.437	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
1.438	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-吡唑-1-基苯基-
1.439	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-吡咯-1-基苯基-
1.440	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
1.441	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-

[0262]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.442	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-噁唑-2-基苯基-
1.443	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(2-甲基噁唑-4-基)苯基-
1.444	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(2-噻吩基)苯基-
1.445	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
1.446	-Me	-Cl	6-F	3-F	1-苯基-4-吡唑基-
1.447	-Me	-Cl	6-F	3-F	1-环丙基-4-吡唑基-
1.448	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.449	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
1.450	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.451	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-氨磺酰基苯基-
1.452	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-氨基甲酰基苯基-
1.453	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
1.454	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.455	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-吗啉代苯基-
1.456	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.457	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
1.458	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
1.459	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
1.460	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
1.461	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
1.462	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
1.463	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-甲基噁唑-4-基)苯基-
1.464	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-
1.465	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
1.466	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	1-苯基-4-吡唑基-
1.467	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-

[0263]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.468	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.469	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
1.470	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.471	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-氨磺酰基苯基-
1.472	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-氨基甲酰基苯基-
1.473	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
1.474	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.475	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-吗啉代苯基-
1.476	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.477	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
1.478	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-吡唑-1-基苯基-
1.479	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-吡咯-1-基苯基-
1.480	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
1.481	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
1.482	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-噁唑-2-基苯基-
1.483	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
1.484	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-噻吩基)苯基-
1.485	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
1.486	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	1-苯基-4-吡唑基-
1.487	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	1-环丙基-4-吡唑基-
1.488	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.489	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
1.490	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.491	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-氨磺酰基苯基-
1.492	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-氨基甲酰基苯基-
1.493	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-

[0264]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.494	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.495	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-吗啉代苯基-
1.496	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.497	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
1.498	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
1.499	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
1.500	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
1.501	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
1.502	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
1.503	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
1.504	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-
1.505	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
1.506	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-苯基-4-吡唑基-
1.507	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-
1.508	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.509	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
1.510	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.511	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-氨磺酰基苯基-
1.512	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-氨基甲酰基苯基-
1.513	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
1.514	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.515	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-吗啉代苯基-
1.516	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.517	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
1.518	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-吡唑-1-基苯基-
1.519	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-吡咯-1-基苯基-

[0265]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.520	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
1.521	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
1.522	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-噁唑-2-基苯基-
1.523	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
1.524	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(2-噻吩基)苯基-
1.525	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
1.526	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	1-苯基-4-吡唑基-
1.527	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	1-环丙基-4-吡唑基-
1.528	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.529	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
1.530	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.531	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-氨磺酰基苯基-
1.532	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-氨基甲酰基苯基-
1.533	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
1.534	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.535	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-吗啉代苯基-
1.536	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.537	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
1.538	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
1.539	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
1.540	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
1.541	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
1.542	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
1.543	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
1.544	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-
1.545	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-

[0266]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.546	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	1-苯基-4-吡唑基-
1.547	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-
1.548	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.549	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
1.550	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.551	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-氨磺酰基苯基-
1.552	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-氨基甲酰基苯基-
1.553	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
1.554	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.555	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-吗啉代苯基-
1.556	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.557	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
1.558	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-吡唑-1-基苯基-
1.559	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-吡咯-1-基苯基-
1.560	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
1.561	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
1.562	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-噁唑-2-基苯基-
1.563	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
1.564	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-噻吩基)苯基-
1.565	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
1.566	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	1-苯基-4-吡唑基-
1.567	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	1-环丙基-4-吡唑基-
1.568	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.569	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
1.570	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.571	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-氨磺酰基苯基-

[0267]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.572	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-氨基甲酰基苯基-
1.573	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
1.574	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.575	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-吗啉代苯基-
1.576	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.577	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
1.578	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
1.579	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
1.580	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
1.581	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
1.582	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
1.583	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
1.584	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-
1.585	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
1.586	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	1-苯基-4-吡唑基-
1.587	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-
1.588	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.589	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
1.590	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.591	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-氨磺酰基苯基-
1.592	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-氨基甲酰基苯基-
1.593	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
1.594	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.595	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-吗啉代苯基-
1.596	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.597	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-

[0268]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.598	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-吡唑-1-基苯基-
1.599	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-吡咯-1-基苯基-
1.600	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
1.601	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
1.602	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-噁唑-2-基苯基-
1.603	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
1.604	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(2-噻吩基)苯基-
1.605	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
1.606	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	1-苯基-4-吡唑基-
1.607	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	1-环丙基-4-吡唑基-
1.608	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.609	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
1.610	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.611	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-氨磺酰基苯基-
1.612	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-氨基甲酰基苯基-
1.613	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
1.614	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.615	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-吗啉代苯基-
1.616	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.617	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
1.618	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
1.619	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
1.620	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
1.621	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
1.622	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
1.623	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-

[0269]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.624	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-
1.625	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
1.626	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	1-苯基-4-吡唑基-
1.627	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-
1.628	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.629	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
1.630	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.631	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-氨磺酰基苯基-
1.632	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-氨基甲酰基苯基-
1.633	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
1.634	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.635	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-吗啉代苯基-
1.636	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.637	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
1.638	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-吡唑-1-基苯基-
1.639	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-吡咯-1-基苯基-
1.640	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-甲基四氢咪唑-2-基)苯基-
1.641	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-甲基-2-咪唑基)苯基-
1.642	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-噁唑-2-基苯基-
1.643	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
1.644	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-噻吩基)苯基-
1.645	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
1.646	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	1-苯基-4-吡唑基-
1.647	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	1-环丙基-4-吡唑基-
1.648	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.649	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y	D
1.650	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.651	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-氨磺酰基苯基-
1.652	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-氨基甲酰基苯基-
1.653	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
1.654	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
1.655	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-吗啉代苯基-
1.656	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
1.657	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
1.658	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
1.659	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
[0270] 1.660	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
1.661	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
1.662	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
1.663	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
1.664	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-
1.665	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
1.666	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-苯基-4-吡唑基-
1.667	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-
1.668	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
1.669	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
1.670	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
1.671	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-氨磺酰基苯基-
1.672	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-氨基甲酰基苯基-

[0271] 表A-2提供了672种具有式(I)的化合物A-2.001至A-2.672,其中G是-H,W是(E)-CH=CH-,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、X、Y、D是如上表1中分别对于化合物编号1.001至1.672所定义的。

[0272] 表A-3提供了672种具有式(I)的化合物A-3.001至A-3.672,其中G是-(C=O) iPr,W是-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、X、Y、D是如上表1中分别对于化合物编号1.001至1.672所定义的。

[0273] 表A-4提供了672种具有式(I)的化合物A-4.001至A-4.672,其中G是-(C=O) iPr,W是(E)-CH=CH-,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、X、Y、D是如上表1中分别对于化合物编号1.001至1.672所定义的。

[0274] 表B-1提供了744种具有式(I)的化合物B-1.001至B-1.744,其中G是-H,W是-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-,X是6-环丙基,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、Y、D是如下表2中分别对于化合物编号2.001至2.744所定义的。

[0275] 表2:R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、Y和D的取代基定义:

[0276]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.001	-Me	-Me	3-F	-Ph
2.002	-Me	-Me	3-F	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-
2.003	-Me	-Me	3-F	1-甲基-吡唑-4-基-
2.004	-Me	-Me	3-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
2.005	-Me	-Me	3-F	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
2.006	-Me	-Me	3-F	2-乙酰胺基噻唑-5-基-
2.007	-Me	-Me	3-F	2-氨基-4-吡啶基-
2.008	-Me	-Me	3-F	2-氯-3-吡啶基-
2.009	-Me	-Me	3-F	2-氯-4-吡啶基-
2.010	-Me	-Me	3-F	2-氯噻唑-5-基-
2.011	-Me	-Me	3-F	2-氟基苯基-
2.012	-Me	-Me	3-F	2-氟基-苯基-
2.013	-Me	-Me	3-F	2-氟-4-吡啶基-
2.014	-Me	-Me	3-F	2-甲基-4-吡啶基-
2.015	-Me	-Me	3-F	2-甲基-三唑-4-基-
2.016	-Me	-Me	3-F	2-甲苯基-

[0277]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.017	-Me	-Me	3-F	2-三氟甲基-4-吡啶基-
2.018	-Me	-Me	3-F	2-三氟甲基-苯基-
2.019	-Me	-Me	3-F	3,4-二氟-苯基-
2.020	-Me	-Me	3-F	3,5-二氟-苯基-
2.021	-Me	-Me	3-F	3-氟-4-氟-苯基-
2.022	-Me	-Me	3-F	3-氟-4-吡啶基-
2.023	-Me	-Me	3-F	3-氟基苯基-
2.024	-Me	-Me	3-F	3-氟基-苯基-
2.025	-Me	-Me	3-F	3-甲基-2-吡啶基-
2.026	-Me	-Me	3-F	3-甲基-4-氨基-苯基-
2.027	-Me	-Me	3-F	3-吡啶基-
2.028	-Me	-Me	3-F	3-甲苯基-
2.029	-Me	-Me	3-F	3-三氟甲基-3-吡啶基-
2.030	-Me	-Me	3-F	3-三氟甲基-苯基-
2.031	-Me	-Me	3-F	4-(二甲基氨基)苯基-
2.032	-Me	-Me	3-F	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
2.033	-Me	-Me	3-F	4-(甲基氨基)-苯基-
2.034	-Me	-Me	3-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
2.035	-Me	-Me	3-F	4-(叔丁氧基)-苯基-
2.036	-Me	-Me	3-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
2.037	-Me	-Me	3-F	4-(三氟甲氧基)-苯基-
2.038	-Me	-Me	3-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
2.039	-Me	-Me	3-F	4-乙酰胺基苯基-
2.040	-Me	-Me	3-F	4-氨基-3-甲基苯基-
2.041	-Me	-Me	3-F	4-氨基-苯基-

[0278]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.042	-Me	-Me	3-F	4-联苯基-
2.043	-Me	-Me	3-F	4-羧基苯基-
2.044	-Me	-Me	3-F	4-氯-3-吡啶基-
2.045	-Me	-Me	3-F	4-氯-苯基-
2.046	-Me	-Me	3-F	4-氟基苯基-
2.047	-Me	-Me	3-F	4-氟基-苯基-
2.048	-Me	-Me	3-F	4-环丙基苯基-
2.049	-Me	-Me	3-F	4-环丙基-苯基-
2.050	-Me	-Me	3-F	4-二甲基氨基苯基-
2.051	-Me	-Me	3-F	4-氟-苯基-
2.052	-Me	-Me	3-F	4-羟基苯基-
2.053	-Me	-Me	3-F	4-羟基-苯基-
2.054	-Me	-Me	3-F	4-甲氧基羰基苯基-
2.055	-Me	-Me	3-F	4-甲基-2-吡啶基-
2.056	-Me	-Me	3-F	4-甲基氨基苯基-
2.057	-Me	-Me	3-F	4-甲基磺酰基苯基-
2.058	-Me	-Me	3-F	4-噁唑-5-基苯基-
2.059	-Me	-Me	3-F	4-吡啶基-
2.060	-Me	-Me	3-F	4-叔丁氧基苯基-
2.061	-Me	-Me	3-F	4-叔丁基苯基-
2.062	-Me	-Me	3-F	4-甲苯基-
2.063	-Me	-Me	3-F	4-三氟甲基-3-吡啶基-
2.064	-Me	-Me	3-F	4-三氟甲基-苯基-
2.065	-Me	-Me	3-F	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-
2.066	-Me	-Me	3-F	5-甲基-2-吡啶基-
2.067	-Me	-Me	3-F	5-甲基-3-吡啶基-

[0279]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.068	-Me	-Me	3-F	6-氯-3-吡啶基-
2.069	-Me	-Me	3-F	6-甲基-2-吡啶基-
2.070	-Me	-Me	3-F	嘧啶-5-基-
2.071	-Me	-Me	3-F	噻唑-2-基-
2.072	-Me	-Me	3-F	噻唑-5-基-
2.073	-Me	-Me	3-F	噻吩-3-基-
2.074	-Me	-Me	3-Cl	-Ph
2.075	-Me	-Me	3-Cl	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-
2.076	-Me	-Me	3-Cl	1-甲基-吡唑-4-基-
2.077	-Me	-Me	3-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
2.078	-Me	-Me	3-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
2.079	-Me	-Me	3-Cl	2-乙酰胺基噻唑-5-基-
2.080	-Me	-Me	3-Cl	2-氨基-4-吡啶基-
2.081	-Me	-Me	3-Cl	2-氯-3-吡啶基-
2.082	-Me	-Me	3-Cl	2-氯-4-吡啶基-
2.083	-Me	-Me	3-Cl	2-氯噻唑-5-基-
2.084	-Me	-Me	3-Cl	2-氟基苯基-
2.085	-Me	-Me	3-Cl	2-氟基-苯基-
2.086	-Me	-Me	3-Cl	2-氟-4-吡啶基-
2.087	-Me	-Me	3-Cl	2-甲基-4-吡啶基-
2.088	-Me	-Me	3-Cl	2-甲基-三唑-4-基-
2.089	-Me	-Me	3-Cl	2-甲苯基-
2.090	-Me	-Me	3-Cl	2-三氟甲基-4-吡啶基-
2.091	-Me	-Me	3-Cl	2-三氟甲基-苯基-
2.092	-Me	-Me	3-Cl	3,4-二氟-苯基-
2.093	-Me	-Me	3-Cl	3,5-二氟-苯基-

[0280]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.094	-Me	-Me	3-Cl	3-氯-4-氟-苯基-
2.095	-Me	-Me	3-Cl	3-氯-4-吡啶基-
2.096	-Me	-Me	3-Cl	3-氟基苯基-
2.097	-Me	-Me	3-Cl	3-氟基-苯基-
2.098	-Me	-Me	3-Cl	3-甲基-2-吡啶基-
2.099	-Me	-Me	3-Cl	3-甲基-4-氨基-苯基-
2.100	-Me	-Me	3-Cl	3-吡啶基-
2.101	-Me	-Me	3-Cl	3-甲苯基-
2.102	-Me	-Me	3-Cl	3-三氟甲基-3-吡啶基-
2.103	-Me	-Me	3-Cl	3-三氟甲基-苯基-
2.104	-Me	-Me	3-Cl	4-(二甲基氨基)苯基-
2.105	-Me	-Me	3-Cl	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
2.106	-Me	-Me	3-Cl	4-(甲基氨基)-苯基-
2.107	-Me	-Me	3-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-
2.108	-Me	-Me	3-Cl	4-(叔丁氧基)-苯基-
2.109	-Me	-Me	3-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
2.110	-Me	-Me	3-Cl	4-(三氟甲氧基)-苯基-
2.111	-Me	-Me	3-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
2.112	-Me	-Me	3-Cl	4-乙酰胺基苯基-
2.113	-Me	-Me	3-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
2.114	-Me	-Me	3-Cl	4-氨基-苯基-
2.115	-Me	-Me	3-Cl	4-联苯基-
2.116	-Me	-Me	3-Cl	4-羧基苯基-
2.117	-Me	-Me	3-Cl	4-氯-3-吡啶基-
2.118	-Me	-Me	3-Cl	4-氯-苯基-

[0281]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.119	-Me	-Me	3-Cl	4-氟基苯基-
2.120	-Me	-Me	3-Cl	4-氟基-苯基-
2.121	-Me	-Me	3-Cl	4-环丙基苯基-
2.122	-Me	-Me	3-Cl	4-环丙基-苯基-
2.123	-Me	-Me	3-Cl	4-二甲基氨基苯基-
2.124	-Me	-Me	3-Cl	4-氟-苯基-
2.125	-Me	-Me	3-Cl	4-羟基苯基-
2.126	-Me	-Me	3-Cl	4-羟基-苯基-
2.127	-Me	-Me	3-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
2.128	-Me	-Me	3-Cl	4-甲基-2-吡啶基-
2.129	-Me	-Me	3-Cl	4-甲基氨基苯基-
2.130	-Me	-Me	3-Cl	4-甲基磺酰基苯基-
2.131	-Me	-Me	3-Cl	4-噁唑-5-基苯基-
2.132	-Me	-Me	3-Cl	4-吡啶基-
2.133	-Me	-Me	3-Cl	4-叔丁氧基苯基-
2.134	-Me	-Me	3-Cl	4-叔丁基苯基-
2.135	-Me	-Me	3-Cl	4-甲苯基-
2.136	-Me	-Me	3-Cl	4-三氟甲基-3-吡啶基-
2.137	-Me	-Me	3-Cl	4-三氟甲基-苯基-
2.138	-Me	-Me	3-Cl	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-
2.139	-Me	-Me	3-Cl	5-甲基-2-吡啶基-
2.140	-Me	-Me	3-Cl	5-甲基-3-吡啶基-
2.141	-Me	-Me	3-Cl	6-氟-3-吡啶基-
2.142	-Me	-Me	3-Cl	6-甲基-2-吡啶基-
2.143	-Me	-Me	3-Cl	噻啶-5-基-
2.144	-Me	-Me	3-Cl	噻唑-2-基-

[0282]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.145	-Me	-Me	3-Cl	噻唑-5-基-
2.146	-Me	-Me	3-Cl	噻吩-3-基-
2.147	-Me	-Cl	3-F	-Ph
2.148	-Me	-Cl	3-F	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-
2.149	-Me	-Cl	3-F	1-甲基-吡唑-4-基-
2.150	-Me	-Cl	3-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
2.151	-Me	-Cl	3-F	2-乙酰氨基-4-吡啶基-
2.152	-Me	-Cl	3-F	2-乙酰氨基噻唑-5-基-
2.153	-Me	-Cl	3-F	2-氨基-4-吡啶基-
2.154	-Me	-Cl	3-F	2-氯-3-吡啶基-
2.155	-Me	-Cl	3-F	2-氯-4-吡啶基-
2.156	-Me	-Cl	3-F	2-氯噻唑-5-基-
2.157	-Me	-Cl	3-F	2-氟基苯基-
2.158	-Me	-Cl	3-F	2-氟基-苯基-
2.159	-Me	-Cl	3-F	2-氟-4-吡啶基-
2.160	-Me	-Cl	3-F	2-甲基-4-吡啶基-
2.161	-Me	-Cl	3-F	2-甲基-三唑-4-基-
2.162	-Me	-Cl	3-F	2-甲苯基-
2.163	-Me	-Cl	3-F	2-三氟甲基-4-吡啶基-
2.164	-Me	-Cl	3-F	2-三氟甲基-苯基-
2.165	-Me	-Cl	3-F	3,4-二氟-苯基-
2.166	-Me	-Cl	3-F	3,5-二氟-苯基-
2.167	-Me	-Cl	3-F	3-氯-4-氟-苯基-
2.168	-Me	-Cl	3-F	3-氯-4-吡啶基-
2.169	-Me	-Cl	3-F	3-氟基苯基-
2.170	-Me	-Cl	3-F	3-氟基-苯基-

[0283]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.171	-Me	-Cl	3-F	3-甲基-2-吡啶基-
2.172	-Me	-Cl	3-F	3-甲基-4-氨基-苯基-
2.173	-Me	-Cl	3-F	3-吡啶基-
2.174	-Me	-Cl	3-F	3-甲苯基-
2.175	-Me	-Cl	3-F	3-三氟甲基-3-吡啶基-
2.176	-Me	-Cl	3-F	3-三氟甲基-苯基-
2.177	-Me	-Cl	3-F	4-(二甲基氨基)苯基-
2.178	-Me	-Cl	3-F	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
2.179	-Me	-Cl	3-F	4-(甲基氨基)-苯基-
2.180	-Me	-Cl	3-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
2.181	-Me	-Cl	3-F	4-(叔丁氧基)-苯基-
2.182	-Me	-Cl	3-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
2.183	-Me	-Cl	3-F	4-(三氟甲氧基)-苯基-
2.184	-Me	-Cl	3-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
2.185	-Me	-Cl	3-F	4-乙酰氨基苯基-
2.186	-Me	-Cl	3-F	4-氨基-3-甲基苯基-
2.187	-Me	-Cl	3-F	4-氨基-苯基-
2.188	-Me	-Cl	3-F	4-联苯基-
2.189	-Me	-Cl	3-F	4-羧基苯基-
2.190	-Me	-Cl	3-F	4-氯-3-吡啶基-
2.191	-Me	-Cl	3-F	4-氯-苯基-
2.192	-Me	-Cl	3-F	4-氟基苯基-
2.193	-Me	-Cl	3-F	4-氟基-苯基-
2.194	-Me	-Cl	3-F	4-环丙基苯基-
2.195	-Me	-Cl	3-F	4-环丙基-苯基-

[0284]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.196	-Me	-Cl	3-F	4-二甲基氨基苯基-
2.197	-Me	-Cl	3-F	4-氟-苯基-
2.198	-Me	-Cl	3-F	4-羟基苯基-
2.199	-Me	-Cl	3-F	4-羟基-苯基-
2.200	-Me	-Cl	3-F	4-甲氧基羰基苯基-
2.201	-Me	-Cl	3-F	4-甲基-2-吡啶基-
2.202	-Me	-Cl	3-F	4-甲基氨基苯基-
2.203	-Me	-Cl	3-F	4-甲基磺酰基苯基-
2.204	-Me	-Cl	3-F	4-噁唑-5-基苯基-
2.205	-Me	-Cl	3-F	4-吡啶基-
2.206	-Me	-Cl	3-F	4-叔丁氧基苯基-
2.207	-Me	-Cl	3-F	4-叔丁基苯基-
2.208	-Me	-Cl	3-F	4-甲基苯基-
2.209	-Me	-Cl	3-F	4-三氟甲基-3-吡啶基-
2.210	-Me	-Cl	3-F	4-三氟甲基-苯基-
2.211	-Me	-Cl	3-F	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-
2.212	-Me	-Cl	3-F	5-甲基-2-吡啶基-
2.213	-Me	-Cl	3-F	5-甲基-3-吡啶基-
2.214	-Me	-Cl	3-F	6-氟-3-吡啶基-
2.215	-Me	-Cl	3-F	6-甲基-2-吡啶基-
2.216	-Me	-Cl	3-F	嘧啶-5-基-
2.217	-Me	-Cl	3-F	噻唑-2-基-
2.218	-Me	-Cl	3-F	噻唑-5-基-
2.219	-Me	-Cl	3-F	噻吩-3-基-
2.220	-Me	-Cl	3-Cl	-Ph
2.221	-Me	-Cl	3-Cl	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-

[0285]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.222	-Me	-Cl	3-Cl	1-甲基-吡唑-4-基-
2.223	-Me	-Cl	3-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
2.224	-Me	-Cl	3-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
2.225	-Me	-Cl	3-Cl	2-乙酰胺基噻唑-5-基-
2.226	-Me	-Cl	3-Cl	2-氨基-4-吡啶基-
2.227	-Me	-Cl	3-Cl	2-氯-3-吡啶基-
2.228	-Me	-Cl	3-Cl	2-氯-4-吡啶基-
2.229	-Me	-Cl	3-Cl	2-氯噻唑-5-基-
2.230	-Me	-Cl	3-Cl	2-氟苯基-
2.231	-Me	-Cl	3-Cl	2-氟基-苯基-
2.232	-Me	-Cl	3-Cl	2-氟-4-吡啶基-
2.233	-Me	-Cl	3-Cl	2-甲基-4-吡啶基-
2.234	-Me	-Cl	3-Cl	2-甲基-三唑-4-基-
2.235	-Me	-Cl	3-Cl	2-甲苯基-
2.236	-Me	-Cl	3-Cl	2-三氟甲基-4-吡啶基-
2.237	-Me	-Cl	3-Cl	2-三氟甲基-苯基-
2.238	-Me	-Cl	3-Cl	3,4-二氟-苯基-
2.239	-Me	-Cl	3-Cl	3,5-二氟-苯基-
2.240	-Me	-Cl	3-Cl	3-氯-4-氟-苯基-
2.241	-Me	-Cl	3-Cl	3-氯-4-吡啶基-
2.242	-Me	-Cl	3-Cl	3-氟苯基-
2.243	-Me	-Cl	3-Cl	3-氟基-苯基-
2.244	-Me	-Cl	3-Cl	3-甲基-2-吡啶基-
2.245	-Me	-Cl	3-Cl	3-甲基-4-氨基-苯基-
2.246	-Me	-Cl	3-Cl	3-吡啶基-
2.247	-Me	-Cl	3-Cl	3-甲苯基-

[0286]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.248	-Me	-Cl	3-Cl	3-三氟甲基-3-吡啶基-
2.249	-Me	-Cl	3-Cl	3-三氟甲基-苯基-
2.250	-Me	-Cl	3-Cl	4-(二甲基氨基)苯基-
2.251	-Me	-Cl	3-Cl	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
2.252	-Me	-Cl	3-Cl	4-(甲基氨基)-苯基-
2.253	-Me	-Cl	3-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-
2.254	-Me	-Cl	3-Cl	4-(叔丁氧基)-苯基-
2.255	-Me	-Cl	3-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
2.256	-Me	-Cl	3-Cl	4-(三氟甲氧基)-苯基-
2.257	-Me	-Cl	3-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
2.258	-Me	-Cl	3-Cl	4-乙酰胺基苯基-
2.259	-Me	-Cl	3-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
2.260	-Me	-Cl	3-Cl	4-氨基-苯基-
2.261	-Me	-Cl	3-Cl	4-联苯基-
2.262	-Me	-Cl	3-Cl	4-羧基苯基-
2.263	-Me	-Cl	3-Cl	4-氯-3-吡啶基-
2.264	-Me	-Cl	3-Cl	4-氯-苯基-
2.265	-Me	-Cl	3-Cl	4-氟基苯基-
2.266	-Me	-Cl	3-Cl	4-氟基-苯基-
2.267	-Me	-Cl	3-Cl	4-环丙基苯基-
2.268	-Me	-Cl	3-Cl	4-环丙基-苯基-
2.269	-Me	-Cl	3-Cl	4-二甲基氨基苯基-
2.270	-Me	-Cl	3-Cl	4-氟-苯基-
2.271	-Me	-Cl	3-Cl	4-羟基苯基-
2.272	-Me	-Cl	3-Cl	4-羟基-苯基-

[0287]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.273	-Me	-Cl	3-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
2.274	-Me	-Cl	3-Cl	4-甲基-2-吡啶基-
2.275	-Me	-Cl	3-Cl	4-甲基氨基苯基-
2.276	-Me	-Cl	3-Cl	4-甲基磺酰基苯基-
2.277	-Me	-Cl	3-Cl	4-噁唑-5-基苯基-
2.278	-Me	-Cl	3-Cl	4-吡啶基-
2.279	-Me	-Cl	3-Cl	4-叔丁氧基苯基-
2.280	-Me	-Cl	3-Cl	4-叔丁基苯基-
2.281	-Me	-Cl	3-Cl	4-甲基苯基-
2.282	-Me	-Cl	3-Cl	4-三氟甲基-3-吡啶基-
2.283	-Me	-Cl	3-Cl	4-三氟甲基-苯基-
2.284	-Me	-Cl	3-Cl	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-
2.285	-Me	-Cl	3-Cl	5-甲基-2-吡啶基-
2.286	-Me	-Cl	3-Cl	5-甲基-3-吡啶基-
2.287	-Me	-Cl	3-Cl	6-氯-3-吡啶基-
2.288	-Me	-Cl	3-Cl	6-甲基-2-吡啶基-
2.289	-Me	-Cl	3-Cl	嘧啶-5-基-
2.290	-Me	-Cl	3-Cl	噻唑-2-基-
2.291	-Me	-Cl	3-Cl	噻唑-5-基-
2.292	-Me	-Cl	3-Cl	噻吩-3-基-
2.293	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	-Ph
2.294	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-
2.295	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	1-甲基-吡唑-4-基-
2.296	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
2.297	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
2.298	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	2-乙酰胺基噻唑-5-基-

[0288]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.299	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	2-氨基-4-吡啶基-
2.300	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	2-氯-3-吡啶基-
2.301	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	2-氯-4-吡啶基-
2.302	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	2-氯噻唑-5-基-
2.303	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	2-氟基苯基-
2.304	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	2-氟基-苯基-
2.305	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	2-氟-4-吡啶基-
2.306	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	2-甲基-4-吡啶基-
2.307	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	2-甲基-三唑-4-基-
2.308	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	2-甲苯基-
2.309	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	2-三氟甲基-4-吡啶基-
2.310	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	2-三氟甲基-苯基-
2.311	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	3,4-二氟-苯基-
2.312	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	3,5-二氟-苯基-
2.313	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	3-氯-4-氟-苯基-
2.314	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	3-氯-4-吡啶基-
2.315	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	3-氟基苯基-
2.316	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	3-氟基-苯基-
2.317	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	3-甲基-2-吡啶基-
2.318	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	3-甲基-4-氨基-苯基-
2.319	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	3-吡啶基-
2.320	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	3-甲苯基-
2.321	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	3-三氟甲基-3-吡啶基-
2.322	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	3-三氟甲基-苯基-
2.323	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(二甲基氨基)苯基-
2.324	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-

[0289]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.325	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(甲基氨基)-苯基-
2.326	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
2.327	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(叔丁氧基)-苯基-
2.328	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
2.329	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(三氟甲氧基)-苯基-
2.330	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
2.331	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-乙酰胺基苯基-
2.332	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-氨基-3-甲基苯基-
2.333	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-氨基-苯基-
2.334	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-联苯基-
2.335	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-羧基苯基-
2.336	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-氟-3-吡啶基-
2.337	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-氟-苯基-
2.338	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-氟基苯基-
2.339	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-氟基-苯基-
2.340	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-环丙基苯基-
2.341	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-环丙基-苯基-
2.342	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-二甲基氨基苯基-
2.343	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-氟-苯基-
2.344	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-羟基苯基-
2.345	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-羟基-苯基-
2.346	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-甲氧基羰基苯基-
2.347	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-甲基-2-吡啶基-
2.348	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-甲基氨基苯基-
2.349	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-甲基磺酰基苯基-

[0290]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.350	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-噁唑-5-基苯基-
2.351	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-吡啶基-
2.352	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-叔丁氧基苯基-
2.353	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-叔丁基苯基-
2.354	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-甲基苯基-
2.355	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-三氟甲基-3-吡啶基-
2.356	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-三氟甲基-苯基-
2.357	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-
2.358	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	5-甲基-2-吡啶基-
2.359	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	5-甲基-3-吡啶基-
2.360	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	6-氯-3-吡啶基-
2.361	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	6-甲基-2-吡啶基-
2.362	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	嘧啶-5-基-
2.363	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	噻唑-2-基-
2.364	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	噻唑-5-基-
2.365	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	噻吩-3-基-
2.366	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	-Ph
2.367	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-
2.368	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	1-甲基-吡唑-4-基-
2.369	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
2.370	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
2.371	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	2-乙酰胺基噻唑-5-基-
2.372	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	2-氨基-4-吡啶基-
2.373	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	2-氯-3-吡啶基-
2.374	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	2-氯-4-吡啶基-
2.375	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	2-氯噻唑-5-基-

[0291]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.376	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	2-氟基苯基-
2.377	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	2-氟基-苯基-
2.378	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	2-氟-4-吡啶基-
2.379	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	2-甲基-4-吡啶基-
2.380	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	2-甲基-三唑-4-基-
2.381	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	2-甲苯基-
2.382	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	2-三氟甲基-4-吡啶基-
2.383	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	2-三氟甲基-苯基-
2.384	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	3,4-二氟-苯基-
2.385	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	3,5-二氟-苯基-
2.386	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	3-氟-4-氟-苯基-
2.387	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	3-氟-4-吡啶基-
2.388	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	3-氟基苯基-
2.389	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	3-氟基-苯基-
2.390	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	3-甲基-2-吡啶基-
2.391	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	3-甲基-4-氨基-苯基-
2.392	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	3-吡啶基-
2.393	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	3-甲苯基-
2.394	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	3-三氟甲基-3-吡啶基-
2.395	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	3-三氟甲基-苯基-
2.396	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(二甲基氨基)苯基-
2.397	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(二甲基氮磺酰基)苯基-
2.398	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(甲基氨基)-苯基-
2.399	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-
2.400	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(叔丁氧基)-苯基-
2.401	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-

[0292]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.402	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(三氟甲氧基)-苯基-
2.403	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
2.404	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-乙酰胺基苯基-
2.405	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
2.406	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-氨基-苯基-
2.407	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-联苯基-
2.408	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-羧基苯基-
2.409	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-氟-3-吡啶基-
2.410	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-氟-苯基-
2.411	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-氟基苯基-
2.412	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-氟基-苯基-
2.413	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-环丙基苯基-
2.414	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-环丙基-苯基-
2.415	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-二甲基氨基苯基-
2.416	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-氟-苯基-
2.417	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-羟基苯基-
2.418	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-羟基-苯基-
2.419	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
2.420	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-甲基-2-吡啶基-
2.421	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-甲基氨基苯基-
2.422	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-甲基磺酰基苯基-
2.423	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-噁唑-5-基苯基-
2.424	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-吡啶基-
2.425	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-叔丁氧基苯基-
2.426	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-叔丁基苯基-

[0293]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.427	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-甲基-
2.428	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-三氟甲基-3-吡啶基-
2.429	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-三氟甲基-苯基-
2.430	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-
2.431	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	5-甲基-2-吡啶基-
2.432	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	5-甲基-3-吡啶基-
2.433	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	6-氯-3-吡啶基-
2.434	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	6-甲基-2-吡啶基-
2.435	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	嘧啶-5-基-
2.436	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	噻唑-2-基-
2.437	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	噻唑-5-基-
2.438	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	噻吩-3-基-
2.439	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	-Ph
2.440	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-
2.441	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	1-甲基-吡唑-4-基-
2.442	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
2.443	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	2-乙酰氨基-4-吡啶基-
2.444	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	2-乙酰氨基噻唑-5-基-
2.445	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	2-氨基-4-吡啶基-
2.446	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	2-氯-3-吡啶基-
2.447	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	2-氯-4-吡啶基-
2.448	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	2-氯噻唑-5-基-
2.449	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	2-氟基苯基-
2.450	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	2-氟基-苯基-
2.451	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	2-氟-4-吡啶基-
2.452	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	2-甲基-4-吡啶基-

[0294]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.453	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	2-甲基-三唑-4-基-
2.454	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	2-甲苯基-
2.455	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	2-三氟甲基-4-吡啶基-
2.456	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	2-三氟甲基-苯基-
2.457	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	3,4-二氟-苯基-
2.458	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	3,5-二氟-苯基-
2.459	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	3-氟-4-氟-苯基-
2.460	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	3-氟-4-吡啶基-
2.461	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	3-氟基苯基-
2.462	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	3-氟基-苯基-
2.463	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	3-甲基-2-吡啶基-
2.464	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	3-甲基-4-氨基-苯基-
2.465	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	3-吡啶基-
2.466	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	3-甲苯基-
2.467	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	3-三氟甲基-3-吡啶基-
2.468	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	3-三氟甲基-苯基-
2.469	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(二甲基氨基)苯基-
2.470	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
2.471	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(甲基氨基)-苯基-
2.472	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
2.473	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(叔丁氧基)-苯基-
2.474	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
2.475	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(三氟甲氧基)-苯基-
2.476	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
2.477	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-乙酰胺基苯基-

[0295]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.478	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-氨基-3-甲基苯基-
2.479	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-氨基-苯基-
2.480	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-联苯基-
2.481	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-羧基苯基-
2.482	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-氯-3-吡啶基-
2.483	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-氯-苯基-
2.484	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-氟基苯基-
2.485	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-氟基-苯基-
2.486	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-环丙基苯基-
2.487	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-环丙基-苯基-
2.488	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-二甲基氨基苯基-
2.489	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-氟-苯基-
2.490	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-羟基苯基-
2.491	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-羟基-苯基-
2.492	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-甲氧基羰基苯基-
2.493	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-甲基-2-吡啶基-
2.494	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-甲基氨基苯基-
2.495	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-甲基磺酰基苯基-
2.496	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-噁唑-5-基苯基-
2.497	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-吡啶基-
2.498	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-叔丁氧基苯基-
2.499	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-叔丁基苯基-
2.500	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-甲苯基-
2.501	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-三氟甲基-3-吡啶基-
2.502	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-三氟甲基-苯基-
2.503	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-

[0296]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.504	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	5-甲基-2-吡啶基-
2.505	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	5-甲基-3-吡啶基-
2.506	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	6-氯-3-吡啶基-
2.507	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	6-甲基-2-吡啶基-
2.508	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	嘧啶-5-基-
2.509	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	噻唑-2-基-
2.510	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	噻唑-5-基-
2.511	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	噻吩-3-基-
2.512	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	-Ph
2.513	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-
2.514	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	1-甲基-吡唑-4-基-
2.515	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
2.516	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
2.517	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-乙酰胺基噻唑-5-基-
2.518	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-氨基-4-吡啶基-
2.519	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-氯-3-吡啶基-
2.520	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-氯-4-吡啶基-
2.521	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-氯噻唑-5-基-
2.522	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-氟基苯基-
2.523	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-氟基-苯基-
2.524	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-氟-4-吡啶基-
2.525	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-甲基-4-吡啶基-
2.526	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-甲基-三唑-4-基-
2.527	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-甲苯基-
2.528	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-三氟甲基-4-吡啶基-
2.529	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-三氟甲基-苯基-

[0297]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.530	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	3,4-二氟-苯基-
2.531	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	3,5-二氟-苯基-
2.532	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-氟-4-氟-苯基-
2.533	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-氟-4-吡啶基-
2.534	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-氟基苯基-
2.535	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-氟基-苯基-
2.536	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-甲基-2-吡啶基-
2.537	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-甲基-4-氨基-苯基-
2.538	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-吡啶基-
2.539	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-甲苯基-
2.540	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-三氟甲基-3-吡啶基-
2.541	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-三氟甲基-苯基-
2.542	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(二甲基氨基)苯基-
2.543	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
2.544	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(甲基氨基)-苯基-
2.545	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-
2.546	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(叔丁氧基)-苯基-
2.547	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
2.548	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(三氟甲氧基)-苯基-
2.549	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基-
2.550	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-乙酰胺基苯基-
2.551	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
2.552	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-氨基-苯基-
2.553	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-联苯基-
2.554	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-羧基苯基-

[0298]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.555	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-氯-3-吡啶基-
2.556	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-氯-苯基-
2.557	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-氟基苯基-
2.558	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-氟基-苯基-
2.559	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-环丙基苯基-
2.560	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-环丙基-苯基-
2.561	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-二甲基氨基苯基-
2.562	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-氟-苯基-
2.563	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-羟基苯基-
2.564	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-羟基-苯基-
2.565	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
2.566	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-甲基-2-吡啶基-
2.567	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-甲基氨基苯基-
2.568	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-甲基磺酰基苯基-
2.569	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-噁唑-5-基苯基-
2.570	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-吡啶基-
2.571	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-叔丁氧基苯基-
2.572	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-叔丁基苯基-
2.573	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-甲苯基-
2.574	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-三氟甲基-3-吡啶基-
2.575	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-三氟甲基-苯基-
2.576	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-
2.577	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	5-甲基-2-吡啶基-
2.578	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	5-甲基-3-吡啶基-
2.579	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	6-氯-3-吡啶基-
2.580	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	6-甲基-2-吡啶基-

[0299]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.581	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	嘧啶-5-基-
2.582	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	噻唑-2-基-
2.583	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	噻唑-5-基-
2.584	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	噻吩-3-基-
2.585	-Me	-Me	3-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
2.586	-Me	-Me	3-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
2.587	-Me	-Me	3-F	4-吗啉代苯基-
2.588	-Me	-Me	3-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
2.589	-Me	-Me	3-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
2.590	-Me	-Me	3-F	4-吡唑-1-基苯基-
2.591	-Me	-Me	3-F	4-吡咯-1-基苯基-
2.592	-Me	-Me	3-F	4-(5-甲基四氢咪喃-2-基)苯基-
2.593	-Me	-Me	3-F	4-(5-甲基-2-咪喃基)苯基-
2.594	-Me	-Me	3-F	4-噁唑-2-基苯基-
2.595	-Me	-Me	3-F	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
2.596	-Me	-Me	3-F	4-(2-噻吩基)苯基-
2.597	-Me	-Me	3-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
2.598	-Me	-Me	3-F	1-苯基-4-吡唑基-
2.599	-Me	-Me	3-F	1-环丙基-4-吡唑基-
2.600	-Me	-Me	3-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
2.601	-Me	-Me	3-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
2.602	-Me	-Me	3-F	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
2.603	-Me	-Me	3-F	4-氨磺酰基苯基-
2.604	-Me	-Me	3-F	4-氨基甲酰基苯基-
2.605	-Me	-Me	3-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
2.606	-Me	-Me	3-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-

[0300]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.607	-Me	-Me	3-Cl	4-吗啉代苯基-
2.608	-Me	-Me	3-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
2.609	-Me	-Me	3-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
2.610	-Me	-Me	3-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
2.611	-Me	-Me	3-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
2.612	-Me	-Me	3-Cl	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
2.613	-Me	-Me	3-Cl	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
2.614	-Me	-Me	3-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
2.615	-Me	-Me	3-Cl	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
2.616	-Me	-Me	3-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-
2.617	-Me	-Me	3-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
2.618	-Me	-Me	3-Cl	1-苯基-4-吡唑基-
2.619	-Me	-Me	3-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-
2.620	-Me	-Me	3-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
2.621	-Me	-Me	3-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
2.622	-Me	-Me	3-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
2.623	-Me	-Me	3-Cl	4-氨磺酰基苯基-
2.624	-Me	-Me	3-Cl	4-氨基甲酰基苯基-
2.625	-Me	-Cl	3-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
2.626	-Me	-Cl	3-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
2.627	-Me	-Cl	3-F	4-吗啉代苯基-
2.628	-Me	-Cl	3-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
2.629	-Me	-Cl	3-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
2.630	-Me	-Cl	3-F	4-吡唑-1-基苯基-
2.631	-Me	-Cl	3-F	4-吡咯-1-基苯基-
2.632	-Me	-Cl	3-F	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-

[0301]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.633	-Me	-Cl	3-F	4-(5-甲基-2-咪唑基)苯基-
2.634	-Me	-Cl	3-F	4-噁唑-2-基苯基-
2.635	-Me	-Cl	3-F	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
2.636	-Me	-Cl	3-F	4-(2-噻吩基)苯基-
2.637	-Me	-Cl	3-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
2.638	-Me	-Cl	3-F	1-苯基-4-吡唑基-
2.639	-Me	-Cl	3-F	1-环丙基-4-吡唑基-
2.640	-Me	-Cl	3-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
2.641	-Me	-Cl	3-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
2.642	-Me	-Cl	3-F	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
2.643	-Me	-Cl	3-F	4-氨磺酰基苯基-
2.644	-Me	-Cl	3-F	4-氨基甲酰基苯基-
2.645	-Me	-Cl	3-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
2.646	-Me	-Cl	3-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
2.647	-Me	-Cl	3-Cl	4-吗啉代苯基-
2.648	-Me	-Cl	3-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
2.649	-Me	-Cl	3-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
2.650	-Me	-Cl	3-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
2.651	-Me	-Cl	3-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
2.652	-Me	-Cl	3-Cl	4-(5-甲基四氢咪唑-2-基)苯基-
2.653	-Me	-Cl	3-Cl	4-(5-甲基-2-咪唑基)苯基-
2.654	-Me	-Cl	3-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
2.655	-Me	-Cl	3-Cl	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
2.656	-Me	-Cl	3-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-
2.657	-Me	-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
2.658	-Me	-Cl	3-Cl	1-苯基-4-吡唑基-

[0302]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.659	-Me	-Cl	3-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-
2.660	-Me	-Cl	3-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
2.661	-Me	-Cl	3-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
2.662	-Me	-Cl	3-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
2.663	-Me	-Cl	3-Cl	4-氨磺酰基苯基-
2.664	-Me	-Cl	3-Cl	4-氨基甲酰基苯基-
2.665	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
2.666	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
2.667	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-吗啉代苯基-
2.668	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
2.669	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
2.670	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-吡唑-1-基苯基-
2.671	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-吡咯-1-基苯基-
2.672	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
2.673	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
2.674	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-噁唑-2-基苯基-
2.675	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
2.676	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(2-噻吩基)苯基-
2.677	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
2.678	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	1-苯基-4-吡唑基-
2.679	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	1-环丙基-4-吡唑基-
2.680	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
2.681	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
2.682	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
2.683	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-氨磺酰基苯基-
2.684	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-F	4-氨基甲酰基苯基-

[0303]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.685	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
2.686	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
2.687	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-吗啉代苯基-
2.688	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
2.689	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
2.690	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
2.691	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
2.692	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
2.693	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
2.694	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
2.695	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
2.696	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-
2.697	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
2.698	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	1-苯基-4-吡唑基-
2.699	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-
2.700	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
2.701	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
2.702	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
2.703	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-氨磺酰基苯基-
2.704	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	3-Cl	4-氨基甲酰基苯基-
2.705	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
2.706	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
2.707	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-吗啉代苯基-
2.708	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
2.709	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
2.710	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-吡唑-1-基苯基-

[0304]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.711	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-吡咯-1-基苯基-
2.712	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
2.713	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
2.714	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-噁唑-2-基苯基-
2.715	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
2.716	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(2-噻吩基)苯基-
2.717	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
2.718	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	1-苯基-4-吡唑基-
2.719	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	1-环丙基-4-吡唑基-
2.720	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
2.721	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
2.722	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-(甲基氮磺酰基)苯基-
2.723	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-氮磺酰基苯基-
2.724	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-F	4-氨基甲酰基苯基-
2.725	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
2.726	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
2.727	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-吗啉代苯基-
2.728	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
2.729	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
2.730	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
2.731	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
2.732	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
2.733	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
2.734	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
2.735	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
2.736	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Y	D
2.737	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
2.738	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	1-苯基-4-吡唑基-
2.739	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-
2.740	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
2.741	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
2.742	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
2.743	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-氨磺酰基苯基-
2.744	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-氨基甲酰基苯基-

[0305] 表B-2提供了744种具有式(I)的化合物B-2.001至B-2.744,其中G是-H,W是(E)-CH=CH-,X是6-环丙基,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、Y、D是如上表2中分别对于化合物编号2.001至2.744所定义的。

[0307] 表B-3提供了744种具有式(I)的化合物B-3.001至B-3.744,其中G是-(C=O) iPr,W是-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-,X是6-环丙基,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、Y、D是如上表2中分别对于化合物编号2.001至2.744所定义的。

[0308] 表B-4提供了744种具有式(I)的化合物B-4.001至B-4.744,其中G是-(C=O) iPr,W是(E)-CH=CH-,X是6-环丙基,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、Y、D是如上表2中分别对于化合物编号2.001至2.744所定义的。

[0309] 表C-1提供了744种具有式(I)的化合物C-1.001至C-1.744,其中G是-H,W是-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-,Y是3-环丙基,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、X和D是如下表3中分别对于化合物编号3.001至3.744所定义的。

[0310] 表3:R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、X和D的取代基定义

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.001	-Me	-Me	6-F	-Ph
3.002	-Me	-Me	6-F	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-
3.003	-Me	-Me	6-F	1-甲基-吡唑-4-基-
3.004	-Me	-Me	6-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-

[0312]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.005	-Me	-Me	6-F	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
3.006	-Me	-Me	6-F	2-乙酰胺基噻唑-5-基-
3.007	-Me	-Me	6-F	2-氨基-4-吡啶基-
3.008	-Me	-Me	6-F	2-氯-3-吡啶基-
3.009	-Me	-Me	6-F	2-氯-4-吡啶基-
3.010	-Me	-Me	6-F	2-氯噻唑-5-基-
3.011	-Me	-Me	6-F	2-氟基苯基-
3.012	-Me	-Me	6-F	2-氟基-苯基-
3.013	-Me	-Me	6-F	2-氟-4-吡啶基-
3.014	-Me	-Me	6-F	2-甲基-4-吡啶基-
3.015	-Me	-Me	6-F	2-甲基-三唑-4-基-
3.016	-Me	-Me	6-F	2-甲苯基-
3.017	-Me	-Me	6-F	2-三氟甲基-4-吡啶基-
3.018	-Me	-Me	6-F	2-三氟甲基-苯基-
3.019	-Me	-Me	6-F	3,4-二氟-苯基-
3.020	-Me	-Me	6-F	3,5-二氟-苯基-
3.021	-Me	-Me	6-F	3-氯-4-氟-苯基-
3.022	-Me	-Me	6-F	3-氯-4-吡啶基-
3.023	-Me	-Me	6-F	3-氟基苯基-
3.024	-Me	-Me	6-F	3-氟基-苯基-
3.025	-Me	-Me	6-F	3-甲基-2-吡啶基-
3.026	-Me	-Me	6-F	3-甲基-4-氨基-苯基-
3.027	-Me	-Me	6-F	3-吡啶基-
3.028	-Me	-Me	6-F	3-甲苯基-
3.029	-Me	-Me	6-F	3-三氟甲基-3-吡啶基-
3.030	-Me	-Me	6-F	3-三氟甲基-苯基-

[0313]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.031	-Me	-Me	6-F	4-(二甲基氨基)苯基-
3.032	-Me	-Me	6-F	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
3.033	-Me	-Me	6-F	4-(甲基氨基)-苯基-
3.034	-Me	-Me	6-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
3.035	-Me	-Me	6-F	4-(叔丁氧基)-苯基-
3.036	-Me	-Me	6-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
3.037	-Me	-Me	6-F	4-(三氟甲氧基)-苯基-
3.038	-Me	-Me	6-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟- 苯基-
3.039	-Me	-Me	6-F	4-乙酰胺基苯基-
3.040	-Me	-Me	6-F	4-氨基-3-甲基苯基-
3.041	-Me	-Me	6-F	4-氨基-苯基-
3.042	-Me	-Me	6-F	4-联苯基-
3.043	-Me	-Me	6-F	4-羧基苯基-
3.044	-Me	-Me	6-F	4-氟-3-吡啶基-
3.045	-Me	-Me	6-F	4-氟-苯基-
3.046	-Me	-Me	6-F	4-氟基苯基-
3.047	-Me	-Me	6-F	4-氟基-苯基-
3.048	-Me	-Me	6-F	4-环丙基苯基-
3.049	-Me	-Me	6-F	4-环丙基-苯基-
3.050	-Me	-Me	6-F	4-二甲基氨基苯基-
3.051	-Me	-Me	6-F	4-氟-苯基-
3.052	-Me	-Me	6-F	4-羟基苯基-
3.053	-Me	-Me	6-F	4-羟基-苯基-
3.054	-Me	-Me	6-F	4-甲氧基羰基苯基-
3.055	-Me	-Me	6-F	4-甲基-2-吡啶基-

[0314]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.056	-Me	-Me	6-F	4-甲基氨基苯基-
3.057	-Me	-Me	6-F	4-甲基磺酰基苯基-
3.058	-Me	-Me	6-F	4-噁唑-5-基苯基-
3.059	-Me	-Me	6-F	4-吡啶基-
3.060	-Me	-Me	6-F	4-叔丁氧基苯基-
3.061	-Me	-Me	6-F	4-叔丁基苯基-
3.062	-Me	-Me	6-F	4-甲基苯基-
3.063	-Me	-Me	6-F	4-三氟甲基-3-吡啶基-
3.064	-Me	-Me	6-F	4-三氟甲基-苯基-
3.065	-Me	-Me	6-F	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-
3.066	-Me	-Me	6-F	5-甲基-2-吡啶基-
3.067	-Me	-Me	6-F	5-甲基-3-吡啶基-
3.068	-Me	-Me	6-F	6-氯-3-吡啶基-
3.069	-Me	-Me	6-F	6-甲基-2-吡啶基-
3.070	-Me	-Me	6-F	嘧啶-5-基-
3.071	-Me	-Me	6-F	噻唑-2-基-
3.072	-Me	-Me	6-F	噻唑-5-基-
3.073	-Me	-Me	6-F	噻吩-3-基-
3.074	-Me	-Me	6-Cl	-Ph
3.075	-Me	-Me	6-Cl	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-
3.076	-Me	-Me	6-Cl	1-甲基-吡唑-4-基-
3.077	-Me	-Me	6-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
3.078	-Me	-Me	6-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
3.079	-Me	-Me	6-Cl	2-乙酰胺基噻唑-5-基-
3.080	-Me	-Me	6-Cl	2-氨基-4-吡啶基-
3.081	-Me	-Me	6-Cl	2-氯-3-吡啶基-

[0315]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.082	-Me	-Me	6-Cl	2-氯-4-吡啶基-
3.083	-Me	-Me	6-Cl	2-氯噻唑-5-基-
3.084	-Me	-Me	6-Cl	2-氟基苯基-
3.085	-Me	-Me	6-Cl	2-氟基-苯基-
3.086	-Me	-Me	6-Cl	2-氟-4-吡啶基-
3.087	-Me	-Me	6-Cl	2-甲基-4-吡啶基-
3.088	-Me	-Me	6-Cl	2-甲基-三唑-4-基-
3.089	-Me	-Me	6-Cl	2-甲苯基-
3.090	-Me	-Me	6-Cl	2-三氟甲基-4-吡啶基-
3.091	-Me	-Me	6-Cl	2-三氟甲基-苯基-
3.092	-Me	-Me	6-Cl	3,4-二氟-苯基-
3.093	-Me	-Me	6-Cl	3,5-二氟-苯基-
3.094	-Me	-Me	6-Cl	3-氯-4-氟-苯基-
3.095	-Me	-Me	6-Cl	3-氯-4-吡啶基-
3.096	-Me	-Me	6-Cl	3-氟基苯基-
3.097	-Me	-Me	6-Cl	3-氟基-苯基-
3.098	-Me	-Me	6-Cl	3-甲基-2-吡啶基-
3.099	-Me	-Me	6-Cl	3-甲基-4-氨基-苯基-
3.100	-Me	-Me	6-Cl	3-吡啶基-
3.101	-Me	-Me	6-Cl	3-甲苯基-
3.102	-Me	-Me	6-Cl	3-三氟甲基-3-吡啶基-
3.103	-Me	-Me	6-Cl	3-三氟甲基-苯基-
3.104	-Me	-Me	6-Cl	4-(二甲基氨基)苯基-
3.105	-Me	-Me	6-Cl	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
3.106	-Me	-Me	6-Cl	4-(甲基氨基)-苯基-
3.107	-Me	-Me	6-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-

[0316]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.108	-Me	-Me	6-Cl	4-(叔丁氧基)-苯基-
3.109	-Me	-Me	6-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
3.110	-Me	-Me	6-Cl	4-(三氟甲氧基)-苯基-
3.111	-Me	-Me	6-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟- 苯基-
3.112	-Me	-Me	6-Cl	4-乙酰胺基苯基-
3.113	-Me	-Me	6-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
3.114	-Me	-Me	6-Cl	4-氨基-苯基-
3.115	-Me	-Me	6-Cl	4-联苯基-
3.116	-Me	-Me	6-Cl	4-羧基苯基-
3.117	-Me	-Me	6-Cl	4-氟-3-吡啶基-
3.118	-Me	-Me	6-Cl	4-氟-苯基-
3.119	-Me	-Me	6-Cl	4-氟基苯基-
3.120	-Me	-Me	6-Cl	4-氟基-苯基-
3.121	-Me	-Me	6-Cl	4-环丙基苯基-
3.122	-Me	-Me	6-Cl	4-环丙基-苯基-
3.123	-Me	-Me	6-Cl	4-二甲基氨基苯基-
3.124	-Me	-Me	6-Cl	4-氟-苯基-
3.125	-Me	-Me	6-Cl	4-羟基苯基-
3.126	-Me	-Me	6-Cl	4-羟基-苯基-
3.127	-Me	-Me	6-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
3.128	-Me	-Me	6-Cl	4-甲基-2-吡啶基-
3.129	-Me	-Me	6-Cl	4-甲基氨基苯基-
3.130	-Me	-Me	6-Cl	4-甲基磺酰基苯基-
3.131	-Me	-Me	6-Cl	4-噁唑-5-基苯基-
3.132	-Me	-Me	6-Cl	4-吡啶基-

[0317]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.133	-Me	-Me	6-Cl	4-叔丁氧基苯基-
3.134	-Me	-Me	6-Cl	4-叔丁基苯基-
3.135	-Me	-Me	6-Cl	4-甲苯基-
3.136	-Me	-Me	6-Cl	4-三氟甲基-3-吡啶基-
3.137	-Me	-Me	6-Cl	4-三氟甲基-苯基-
3.138	-Me	-Me	6-Cl	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-
3.139	-Me	-Me	6-Cl	5-甲基-2-吡啶基-
3.140	-Me	-Me	6-Cl	5-甲基-3-吡啶基-
3.141	-Me	-Me	6-Cl	6-氯-3-吡啶基-
3.142	-Me	-Me	6-Cl	6-甲基-2-吡啶基-
3.143	-Me	-Me	6-Cl	嘧啶-5-基-
3.144	-Me	-Me	6-Cl	噻唑-2-基-
3.145	-Me	-Me	6-Cl	噻唑-5-基-
3.146	-Me	-Me	6-Cl	噻吩-3-基-
3.147	-Me	-Cl	6-F	-Ph
3.148	-Me	-Cl	6-F	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-
3.149	-Me	-Cl	6-F	1-甲基-吡唑-4-基-
3.150	-Me	-Cl	6-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
3.151	-Me	-Cl	6-F	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
3.152	-Me	-Cl	6-F	2-乙酰胺基噻唑-5-基-
3.153	-Me	-Cl	6-F	2-氨基-4-吡啶基-
3.154	-Me	-Cl	6-F	2-氯-3-吡啶基-
3.155	-Me	-Cl	6-F	2-氯-4-吡啶基-
3.156	-Me	-Cl	6-F	2-氯噻唑-5-基-
3.157	-Me	-Cl	6-F	2-氟基苯基-
3.158	-Me	-Cl	6-F	2-氟基-苯基-

[0318]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.159	-Me	-Cl	6-F	2-氟-4-吡啶基-
3.160	-Me	-Cl	6-F	2-甲基-4-吡啶基-
3.161	-Me	-Cl	6-F	2-甲基-三唑-4-基-
3.162	-Me	-Cl	6-F	2-甲苯基-
3.163	-Me	-Cl	6-F	2-三氟甲基-4-吡啶基-
3.164	-Me	-Cl	6-F	2-三氟甲基-苯基-
3.165	-Me	-Cl	6-F	3,4-二氟-苯基-
3.166	-Me	-Cl	6-F	3,5-二氟-苯基-
3.167	-Me	-Cl	6-F	3-氟-4-氟-苯基-
3.168	-Me	-Cl	6-F	3-氟-4-吡啶基-
3.169	-Me	-Cl	6-F	3-氟基苯基-
3.170	-Me	-Cl	6-F	3-氟基-苯基-
3.171	-Me	-Cl	6-F	3-甲基-2-吡啶基-
3.172	-Me	-Cl	6-F	3-甲基-4-氨基-苯基-
3.173	-Me	-Cl	6-F	3-吡啶基-
3.174	-Me	-Cl	6-F	3-甲苯基-
3.175	-Me	-Cl	6-F	3-三氟甲基-3-吡啶基-
3.176	-Me	-Cl	6-F	3-三氟甲基-苯基-
3.177	-Me	-Cl	6-F	4-(二甲基氨基)苯基-
3.178	-Me	-Cl	6-F	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
3.179	-Me	-Cl	6-F	4-(甲基氨基)-苯基-
3.180	-Me	-Cl	6-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
3.181	-Me	-Cl	6-F	4-(叔丁氧基)-苯基-
3.182	-Me	-Cl	6-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
3.183	-Me	-Cl	6-F	4-(三氟甲氧基)-苯基-
3.184	-Me	-Cl	6-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-

[0319]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
				苯基-
3.185	-Me	-Cl	6-F	4-乙酰胺基苯基-
3.186	-Me	-Cl	6-F	4-氨基-3-甲基苯基-
3.187	-Me	-Cl	6-F	4-氨基-苯基-
3.188	-Me	-Cl	6-F	4-联苯基-
3.189	-Me	-Cl	6-F	4-羧基苯基-
3.190	-Me	-Cl	6-F	4-氯-3-吡啶基-
3.191	-Me	-Cl	6-F	4-氯-苯基-
3.192	-Me	-Cl	6-F	4-氟基苯基-
3.193	-Me	-Cl	6-F	4-氟基-苯基-
3.194	-Me	-Cl	6-F	4-环丙基苯基-
3.195	-Me	-Cl	6-F	4-环丙基-苯基-
3.196	-Me	-Cl	6-F	4-二甲基氨基苯基-
3.197	-Me	-Cl	6-F	4-氟-苯基-
3.198	-Me	-Cl	6-F	4-羟基苯基-
3.199	-Me	-Cl	6-F	4-羟基-苯基-
3.200	-Me	-Cl	6-F	4-甲氧基羰基苯基-
3.201	-Me	-Cl	6-F	4-甲基-2-吡啶基-
3.202	-Me	-Cl	6-F	4-甲基氨基苯基-
3.203	-Me	-Cl	6-F	4-甲基磺酰基苯基-
3.204	-Me	-Cl	6-F	4-噁唑-5-基苯基-
3.205	-Me	-Cl	6-F	4-吡啶基-
3.206	-Me	-Cl	6-F	4-叔丁氧基苯基-
3.207	-Me	-Cl	6-F	4-叔丁基苯基-
3.208	-Me	-Cl	6-F	4-甲苯基-
3.209	-Me	-Cl	6-F	4-三氟甲基-3-吡啶基-

[0320]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.210	-Me	-Cl	6-F	4-三氟甲基-苯基-
3.211	-Me	-Cl	6-F	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-
3.212	-Me	-Cl	6-F	5-甲基-2-吡啶基-
3.213	-Me	-Cl	6-F	5-甲基-3-吡啶基-
3.214	-Me	-Cl	6-F	6-氟-3-吡啶基-
3.215	-Me	-Cl	6-F	6-甲基-2-吡啶基-
3.216	-Me	-Cl	6-F	嘧啶-5-基-
3.217	-Me	-Cl	6-F	噻唑-2-基-
3.218	-Me	-Cl	6-F	噻唑-5-基-
3.219	-Me	-Cl	6-F	噻吩-3-基-
3.220	-Me	-Cl	6-Cl	-Ph
3.221	-Me	-Cl	6-Cl	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-
3.222	-Me	-Cl	6-Cl	1-甲基-吡唑-4-基-
3.223	-Me	-Cl	6-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
3.224	-Me	-Cl	6-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
3.225	-Me	-Cl	6-Cl	2-乙酰胺基噻唑-5-基-
3.226	-Me	-Cl	6-Cl	2-氨基-4-吡啶基-
3.227	-Me	-Cl	6-Cl	2-氟-3-吡啶基-
3.228	-Me	-Cl	6-Cl	2-氟-4-吡啶基-
3.229	-Me	-Cl	6-Cl	2-氟噻唑-5-基-
3.230	-Me	-Cl	6-Cl	2-氟基苯基-
3.231	-Me	-Cl	6-Cl	2-氟基-苯基-
3.232	-Me	-Cl	6-Cl	2-氟-4-吡啶基-
3.233	-Me	-Cl	6-Cl	2-甲基-4-吡啶基-
3.234	-Me	-Cl	6-Cl	2-甲基-三唑-4-基-
3.235	-Me	-Cl	6-Cl	2-甲苯基-

[0321]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.236	-Me	-Cl	6-Cl	2-三氟甲基-4-吡啶基-
3.237	-Me	-Cl	6-Cl	2-三氟甲基-苯基-
3.238	-Me	-Cl	6-Cl	3,4-二氟-苯基-
3.239	-Me	-Cl	6-Cl	3,5-二氟-苯基-
3.240	-Me	-Cl	6-Cl	3-氟-4-氟-苯基-
3.241	-Me	-Cl	6-Cl	3-氟-4-吡啶基-
3.242	-Me	-Cl	6-Cl	3-氟基苯基-
3.243	-Me	-Cl	6-Cl	3-氟基-苯基-
3.244	-Me	-Cl	6-Cl	3-甲基-2-吡啶基-
3.245	-Me	-Cl	6-Cl	3-甲基-4-氨基-苯基-
3.246	-Me	-Cl	6-Cl	3-吡啶基-
3.247	-Me	-Cl	6-Cl	3-甲苯基-
3.248	-Me	-Cl	6-Cl	3-三氟甲基-3-吡啶基-
3.249	-Me	-Cl	6-Cl	3-三氟甲基-苯基-
3.250	-Me	-Cl	6-Cl	4-(二甲基氨基)苯基-
3.251	-Me	-Cl	6-Cl	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
3.252	-Me	-Cl	6-Cl	4-(甲基氨基)-苯基-
3.253	-Me	-Cl	6-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-
3.254	-Me	-Cl	6-Cl	4-(叔丁氧基)-苯基-
3.255	-Me	-Cl	6-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
3.256	-Me	-Cl	6-Cl	4-(三氟甲氧基)-苯基-
3.257	-Me	-Cl	6-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟- 苯基-
3.258	-Me	-Cl	6-Cl	4-乙酰胺基苯基-
3.259	-Me	-Cl	6-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
3.260	-Me	-Cl	6-Cl	4-氨基-苯基-

[0322]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.261	-Me	-Cl	6-Cl	4-联苯基-
3.262	-Me	-Cl	6-Cl	4-羧基苯基-
3.263	-Me	-Cl	6-Cl	4-氯-3-吡啶基-
3.264	-Me	-Cl	6-Cl	4-氯-苯基-
3.265	-Me	-Cl	6-Cl	4-氟基苯基-
3.266	-Me	-Cl	6-Cl	4-氟基-苯基-
3.267	-Me	-Cl	6-Cl	4-环丙基苯基-
3.268	-Me	-Cl	6-Cl	4-环丙基-苯基-
3.269	-Me	-Cl	6-Cl	4-二甲基氨基苯基-
3.270	-Me	-Cl	6-Cl	4-氟-苯基-
3.271	-Me	-Cl	6-Cl	4-羟基苯基-
3.272	-Me	-Cl	6-Cl	4-羟基-苯基-
3.273	-Me	-Cl	6-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
3.274	-Me	-Cl	6-Cl	4-甲基-2-吡啶基-
3.275	-Me	-Cl	6-Cl	4-甲基氨基苯基-
3.276	-Me	-Cl	6-Cl	4-甲基磺酰基苯基-
3.277	-Me	-Cl	6-Cl	4-噁唑-5-基苯基-
3.278	-Me	-Cl	6-Cl	4-吡啶基-
3.279	-Me	-Cl	6-Cl	4-叔丁氧基苯基-
3.280	-Me	-Cl	6-Cl	4-叔丁基苯基-
3.281	-Me	-Cl	6-Cl	4-甲苯基-
3.282	-Me	-Cl	6-Cl	4-三氟甲基-3-吡啶基-
3.283	-Me	-Cl	6-Cl	4-三氟甲基-苯基-
3.284	-Me	-Cl	6-Cl	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-
3.285	-Me	-Cl	6-Cl	5-甲基-2-吡啶基-
3.286	-Me	-Cl	6-Cl	5-甲基-3-吡啶基-

[0323]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.287	-Me	-Cl	6-Cl	6-氯-3-吡啶基-
3.288	-Me	-Cl	6-Cl	6-甲基-2-吡啶基-
3.289	-Me	-Cl	6-Cl	嘧啶-5-基-
3.290	-Me	-Cl	6-Cl	噻唑-2-基-
3.291	-Me	-Cl	6-Cl	噻唑-5-基-
3.292	-Me	-Cl	6-Cl	噻吩-3-基-
3.293	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	-Ph
3.294	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-
3.295	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	1-甲基-吡唑-4-基-
3.296	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
3.297	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
3.298	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	2-乙酰胺基噻唑-5-基-
3.299	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	2-氨基-4-吡啶基-
3.300	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	2-氯-3-吡啶基-
3.301	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	2-氯-4-吡啶基-
3.302	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	2-氯噻唑-5-基-
3.303	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	2-氟基苯基-
3.304	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	2-氟基-苯基-
3.305	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	2-氟-4-吡啶基-
3.306	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	2-甲基-4-吡啶基-
3.307	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	2-甲基-三唑-4-基-
3.308	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	2-甲苯基-
3.309	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	2-三氟甲基-4-吡啶基-
3.310	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	2-三氟甲基-苯基-
3.311	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3,4-二氟-苯基-
3.312	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3,5-二氟-苯基-

[0324]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.313	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-氯-4-氟-苯基-
3.314	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-氯-4-吡啶基-
3.315	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-氟基苯基-
3.316	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-氟基-苯基-
3.317	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-甲基-2-吡啶基-
3.318	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-甲基-4-氨基-苯基-
3.319	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-吡啶基-
3.320	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-甲苯基-
3.321	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-三氟甲基-3-吡啶基-
3.322	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	3-三氟甲基-苯基-
3.323	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(二甲基氨基)苯基-
3.324	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
3.325	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(甲基氨基)-苯基-
3.326	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
3.327	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(叔丁氧基)-苯基-
3.328	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
3.329	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(三氟甲氧基)-苯基-
3.330	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟- 苯基-
3.331	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-乙酰胺基苯基-
3.332	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-氨基-3-甲基苯基-
3.333	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-氨基-苯基-
3.334	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-联苯基-
3.335	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-羧基苯基-
3.336	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-氯-3-吡啶基-
3.337	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-氯-苯基-

[0325]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.338	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-氟基苯基-
3.339	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-氟基-苯基-
3.340	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-环丙基苯基-
3.341	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-环丙基-苯基-
3.342	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-二甲基氨基苯基-
3.343	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-氟-苯基-
3.344	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-羟基苯基-
3.345	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-羟基-苯基-
3.346	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-甲氧基羰基苯基-
3.347	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-甲基-2-吡啶基-
3.348	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-甲基氨基苯基-
3.349	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-甲基磺酰基苯基-
3.350	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-噁唑-5-基苯基-
3.351	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-吡啶基-
3.352	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-叔丁氧基苯基-
3.353	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-叔丁基苯基-
3.354	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-甲苯基-
3.355	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-三氟甲基-3-吡啶基-
3.356	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-三氟甲基-苯基-
3.357	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-
3.358	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	5-甲基-2-吡啶基-
3.359	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	5-甲基-3-吡啶基-
3.360	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	6-氯-3-吡啶基-
3.361	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	6-甲基-2-吡啶基-
3.362	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	嘧啶-5-基-
3.363	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	噻唑-2-基-

[0326]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.364	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	噻唑-5-基-
3.365	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	噻吩-3-基-
3.366	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	-Ph
3.367	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-
3.368	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	1-甲基-吡唑-4-基-
3.369	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
3.370	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
3.371	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	2-乙酰胺基噻唑-5-基-
3.372	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	2-氟基-4-吡啶基-
3.373	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	2-氯-3-吡啶基-
3.374	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	2-氯-4-吡啶基-
3.375	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	2-氯噻唑-5-基-
3.376	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	2-氟基苯基-
3.377	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	2-氟基-苯基-
3.378	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	2-氟-4-吡啶基-
3.379	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	2-甲基-4-吡啶基-
3.380	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	2-甲基-三唑-4-基-
3.381	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	2-甲苯基-
3.382	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	2-三氟甲基-4-吡啶基-
3.383	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	2-三氟甲基-苯基-
3.384	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3,4-二氟-苯基-
3.385	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3,5-二氟-苯基-
3.386	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-氯-4-氟-苯基-
3.387	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-氯-4-吡啶基-
3.388	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-氟基苯基-
3.389	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-氟基-苯基-

[0327]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.390	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-甲基-2-吡啶基-
3.391	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-甲基-4-氨基-苯基-
3.392	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-吡啶基-
3.393	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-甲苯基-
3.394	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-三氟甲基-3-吡啶基-
3.395	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	3-三氟甲基-苯基-
3.396	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(二甲基氨基)苯基-
3.397	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
3.398	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(甲基氨基)-苯基-
3.399	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-
3.400	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(叔丁氧基)-苯基-
3.401	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
3.402	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(三氟甲氧基)-苯基-
3.403	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟- 苯基-
3.404	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-乙酰胺基苯基-
3.405	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
3.406	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-氨基-苯基-
3.407	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-联苯基-
3.408	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-羧基苯基-
3.409	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-氟-3-吡啶基-
3.410	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-氟-苯基-
3.411	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-氟基苯基-
3.412	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-氟基-苯基-
3.413	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-环丙基苯基-
3.414	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-环丙基-苯基-

[0328]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.415	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-二甲基氨基苯基-
3.416	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-氟-苯基-
3.417	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-羟基苯基-
3.418	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-羟基-苯基-
3.419	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
3.420	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-甲基-2-吡啶基-
3.421	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-甲基氨基苯基-
3.422	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-甲基磺酰基苯基-
3.423	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-噁唑-5-基苯基-
3.424	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-吡啶基-
3.425	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-叔丁氧基苯基-
3.426	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-叔丁基苯基-
3.427	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-甲基苯基-
3.428	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-三氟甲基-3-吡啶基-
3.429	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-三氟甲基-苯基-
3.430	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-
3.431	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	5-甲基-2-吡啶基-
3.432	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	5-甲基-3-吡啶基-
3.433	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	6-氯-3-吡啶基-
3.434	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	6-甲基-2-吡啶基-
3.435	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	嘧啶-5-基-
3.436	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	噻唑-2-基-
3.437	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	噻唑-5-基-
3.438	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	噻吩-3-基-
3.439	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	-Ph
3.440	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-

[0329]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.441	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	1-甲基-吡唑-4-基-
3.442	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
3.443	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
3.444	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	2-乙酰胺基噻唑-5-基-
3.445	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	2-氨基-4-吡啶基-
3.446	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	2-氯-3-吡啶基-
3.447	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	2-氯-4-吡啶基-
3.448	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	2-氯噻唑-5-基-
3.449	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	2-氟基苯基-
3.450	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	2-氟基-苯基-
3.451	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	2-氟-4-吡啶基-
3.452	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	2-甲基-4-吡啶基-
3.453	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	2-甲基-三唑-4-基-
3.454	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	2-甲苯基-
3.455	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	2-三氟甲基-4-吡啶基-
3.456	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	2-三氟甲基-苯基-
3.457	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3,4-二氟-苯基-
3.458	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3,5-二氟-苯基-
3.459	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-氯-4-氟-苯基-
3.460	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-氯-4-吡啶基-
3.461	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-氟基苯基-
3.462	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-氟基-苯基-
3.463	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-甲基-2-吡啶基-
3.464	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-甲基-4-氨基-苯基-
3.465	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-吡啶基-
3.466	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-甲苯基-

[0330]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.467	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-三氟甲基-3-吡啶基-
3.468	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	3-三氟甲基-苯基-
3.469	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(二甲基氨基)苯基-
3.470	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-
3.471	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(甲基氨基)-苯基-
3.472	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(甲基硫烷基)苯基-
3.473	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(叔丁氧基)-苯基-
3.474	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
3.475	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(三氟甲氧基)-苯基-
3.476	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟- 苯基-
3.477	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-乙酰胺基苯基-
3.478	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-氨基-3-甲基苯基-
3.479	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-氨基-苯基-
3.480	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-联苯基-
3.481	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-羧基苯基-
3.482	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-氟-3-吡啶基-
3.483	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-氟-苯基-
3.484	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-氟基苯基-
3.485	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-氟基-苯基-
3.486	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-环丙基苯基-
3.487	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-环丙基-苯基-
3.488	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-二甲基氨基苯基-
3.489	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-氟-苯基-
3.490	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-羟基苯基-
3.491	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-羟基-苯基-

[0331]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.492	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-甲氧基羰基苯基-
3.493	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-甲基-2-吡啶基-
3.494	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-甲基氨基苯基-
3.495	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-甲基磺酰基苯基-
3.496	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-噁唑-5-基苯基-
3.497	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-吡啶基-
3.498	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-叔丁氧基苯基-
3.499	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-叔丁基苯基-
3.500	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-甲苯基-
3.501	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-三氟甲基-3-吡啶基-
3.502	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-三氟甲基-苯基-
3.503	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-
3.504	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	5-甲基-2-吡啶基-
3.505	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	5-甲基-3-吡啶基-
3.506	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	6-氯-3-吡啶基-
3.507	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	6-甲基-2-吡啶基-
3.508	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	嘧啶-5-基-
3.509	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	噻唑-2-基-
3.510	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	噻唑-5-基-
3.511	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	噻吩-3-基-
3.512	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	-Ph
3.513	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-4-基-
3.514	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	1-甲基-吡唑-4-基-
3.515	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-
3.516	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-乙酰胺基-4-吡啶基-
3.517	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-乙酰胺基噻唑-5-基-

[0332]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.518	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-氨基-4-吡啶基-
3.519	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-氟-3-吡啶基-
3.520	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-氟-4-吡啶基-
3.521	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-氟噻唑-5-基-
3.522	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-氟苯基-
3.523	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-氟基-苯基-
3.524	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-氟-4-吡啶基-
3.525	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-甲基-4-吡啶基-
3.526	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-甲基-三唑-4-基-
3.527	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-甲苯基-
3.528	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-三氟甲基-4-吡啶基-
3.529	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-三氟甲基-苯基-
3.530	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3,4-二氟-苯基-
3.531	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3,5-二氟-苯基-
3.532	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-氟-4-氟-苯基-
3.533	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-氟-4-吡啶基-
3.534	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-氟苯基-
3.535	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-氟基-苯基-
3.536	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-甲基-2-吡啶基-
3.537	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-甲基-4-氨基-苯基-
3.538	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-吡啶基-
3.539	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-甲苯基-
3.540	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-三氟甲基-3-吡啶基-
3.541	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-三氟甲基-苯基-
3.542	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(二甲基氨基)苯基-
3.543	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(二甲基氨基磺酰基)苯基-

[0333]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.544	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(甲基氨基)-苯基-
3.545	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(甲基硫烷基)苯基-
3.546	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(叔丁氧基)-苯基-
3.547	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-
3.548	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(三氟甲氧基)-苯基-
3.549	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟- 苯基-
3.550	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-乙酰胺基苯基-
3.551	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-氨基-3-甲基苯基-
3.552	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-氨基-苯基-
3.553	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-联苯基-
3.554	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-羧基苯基-
3.555	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-氟-3-吡啶基-
3.556	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-氟-苯基-
3.557	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-氟基苯基-
3.558	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-氟基-苯基-
3.559	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-环丙基苯基-
3.560	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-环丙基-苯基-
3.561	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-二甲基氨基苯基-
3.562	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-氟-苯基-
3.563	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-羟基苯基-
3.564	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-羟基-苯基-
3.565	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-甲氧基羰基苯基-
3.566	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-甲基-2-吡啶基-
3.567	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-甲基氨基苯基-
3.568	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-甲基磺酰基苯基-

[0334]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.569	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-噁唑-5-基苯基-
3.570	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-吡啶基-
3.571	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-叔丁氧基苯基-
3.572	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-叔丁基苯基-
3.573	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-甲基苯基-
3.574	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-三氟甲基-3-吡啶基-
3.575	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-三氟甲基-苯基-
3.576	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基-
3.577	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	5-甲基-2-吡啶基-
3.578	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	5-甲基-3-吡啶基-
3.579	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	6-氯-3-吡啶基-
3.580	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	6-甲基-2-吡啶基-
3.581	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	嘧啶-5-基-
3.582	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	噻唑-2-基-
3.583	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	噻唑-5-基-
3.584	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	噻吩-3-基-
3.585	-Me	-Me	6-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
3.586	-Me	-Me	6-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
3.587	-Me	-Me	6-F	4-吗啉代苯基-
3.588	-Me	-Me	6-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
3.589	-Me	-Me	6-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
3.590	-Me	-Me	6-F	4-吡唑-1-基苯基-
3.591	-Me	-Me	6-F	4-吡咯-1-基苯基-
3.592	-Me	-Me	6-F	4-(5-甲基四氢咪唑-2-基)苯基-
3.593	-Me	-Me	6-F	4-(5-甲基-2-咪唑基)苯基-
3.594	-Me	-Me	6-F	4-噁唑-2-基苯基-

[0335]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.595	-Me	-Me	6-F	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
3.596	-Me	-Me	6-F	4-(2-噻吩基)苯基-
3.597	-Me	-Me	6-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
3.598	-Me	-Me	6-F	1-苯基-4-吡唑基-
3.599	-Me	-Me	6-F	1-环丙基-4-吡唑基-
3.600	-Me	-Me	6-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
3.601	-Me	-Me	6-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
3.602	-Me	-Me	6-F	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
3.603	-Me	-Me	6-F	4-氨磺酰基苯基-
3.604	-Me	-Me	6-F	4-氨基甲酰基苯基-
3.605	-Me	-Me	6-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
3.606	-Me	-Me	6-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
3.607	-Me	-Me	6-Cl	4-吗啉代苯基-
3.608	-Me	-Me	6-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
3.609	-Me	-Me	6-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
3.610	-Me	-Me	6-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
3.611	-Me	-Me	6-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
3.612	-Me	-Me	6-Cl	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
3.613	-Me	-Me	6-Cl	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
3.614	-Me	-Me	6-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
3.615	-Me	-Me	6-Cl	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
3.616	-Me	-Me	6-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-
3.617	-Me	-Me	6-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
3.618	-Me	-Me	6-Cl	1-苯基-4-吡唑基-
3.619	-Me	-Me	6-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-
3.620	-Me	-Me	6-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-

[0336]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.621	-Me	-Me	6-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
3.622	-Me	-Me	6-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
3.623	-Me	-Me	6-Cl	4-氨磺酰基苯基-
3.624	-Me	-Me	6-Cl	4-氨基甲酰基苯基-
3.625	-Me	-Cl	6-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
3.626	-Me	-Cl	6-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
3.627	-Me	-Cl	6-F	4-吗啉代苯基-
3.628	-Me	-Cl	6-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
3.629	-Me	-Cl	6-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
3.630	-Me	-Cl	6-F	4-吡唑-1-基苯基-
3.631	-Me	-Cl	6-F	4-吡咯-1-基苯基-
3.632	-Me	-Cl	6-F	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
3.633	-Me	-Cl	6-F	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
3.634	-Me	-Cl	6-F	4-噁唑-2-基苯基-
3.635	-Me	-Cl	6-F	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
3.636	-Me	-Cl	6-F	4-(2-噻吩基)苯基-
3.637	-Me	-Cl	6-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
3.638	-Me	-Cl	6-F	1-苯基-4-吡唑基-
3.639	-Me	-Cl	6-F	1-环丙基-4-吡唑基-
3.640	-Me	-Cl	6-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
3.641	-Me	-Cl	6-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
3.642	-Me	-Cl	6-F	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
3.643	-Me	-Cl	6-F	4-氨磺酰基苯基-
3.644	-Me	-Cl	6-F	4-氨基甲酰基苯基-
3.645	-Me	-Cl	6-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
3.646	-Me	-Cl	6-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-

[0337]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.647	-Me	-Cl	6-Cl	4-吗啉代苯基-
3.648	-Me	-Cl	6-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
3.649	-Me	-Cl	6-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
3.650	-Me	-Cl	6-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
3.651	-Me	-Cl	6-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
3.652	-Me	-Cl	6-Cl	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
3.653	-Me	-Cl	6-Cl	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
3.654	-Me	-Cl	6-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
3.655	-Me	-Cl	6-Cl	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
3.656	-Me	-Cl	6-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-
3.657	-Me	-Cl	6-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
3.658	-Me	-Cl	6-Cl	1-苯基-4-吡唑基-
3.659	-Me	-Cl	6-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-
3.660	-Me	-Cl	6-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
3.661	-Me	-Cl	6-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
3.662	-Me	-Cl	6-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
3.663	-Me	-Cl	6-Cl	4-氨磺酰基苯基-
3.664	-Me	-Cl	6-Cl	4-氨基甲酰基苯基-
3.665	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
3.666	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
3.667	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-吗啉代苯基-
3.668	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
3.669	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
3.670	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-吡唑-1-基苯基-
3.671	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-吡咯-1-基苯基-
3.672	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-

[0338]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.673	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(5-甲基-2-咪唑基)苯基-
3.674	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-噁唑-2-基苯基-
3.675	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(2-甲基噁唑-4-基)苯基-
3.676	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(2-噻吩基)苯基-
3.677	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
3.678	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	1-苯基-4-吡唑基-
3.679	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	1-环丙基-4-吡唑基-
3.680	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
3.681	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
3.682	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
3.683	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-氨磺酰基苯基-
3.684	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-F	4-氨基甲酰基苯基-
3.685	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
3.686	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
3.687	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-吗啉代苯基-
3.688	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
3.689	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
3.690	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
3.691	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
3.692	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(5-甲基四氢咪唑-2-基)苯基-
3.693	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(5-甲基-2-咪唑基)苯基-
3.694	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
3.695	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(2-甲基噁唑-4-基)苯基-
3.696	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-
3.697	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
3.698	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	1-苯基-4-吡唑基-

[0339]

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.699	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-
3.700	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
3.701	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
3.702	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
3.703	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-氨磺酰基苯基-
3.704	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Me	6-Cl	4-氨基甲酰基苯基-
3.705	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
3.706	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
3.707	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-吗啉代苯基-
3.708	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
3.709	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
3.710	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-吡唑-1-基苯基-
3.711	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-吡咯-1-基苯基-
3.712	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
3.713	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(5-甲基-2-呋喃基)苯基-
3.714	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-噁唑-2-基苯基-
3.715	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
3.716	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(2-噻吩基)苯基-
3.717	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
3.718	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	1-苯基-4-吡唑基-
3.719	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	1-环丙基-4-吡唑基-
3.720	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
3.721	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
3.722	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
3.723	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-氨磺酰基苯基-
3.724	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-F	4-氨基甲酰基苯基-

化合物 编号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	D
3.725	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(1-甲基吡唑-3-基)苯基-
3.726	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-
3.727	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-吗啉代苯基-
3.728	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(3-甲基吡唑-1-基)苯基-
3.729	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(3,5-二甲基吡唑-1-基)苯基-
3.730	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-吡唑-1-基苯基-
3.731	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-吡咯-1-基苯基-
3.732	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(5-甲基四氢呋喃-2-基)苯基-
3.733	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(5-甲基-2-咪唑基)苯基-
3.734	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-噁唑-2-基苯基-
3.735	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(2-甲基噻唑-4-基)苯基-
3.736	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(2-噻吩基)苯基-
3.737	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基-
3.738	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	1-苯基-4-吡唑基-
3.739	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	1-环丙基-4-吡唑基-
3.740	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(甲基硫烷基甲基)苯基-
3.741	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(异丙基硫烷基甲基)苯基-
3.742	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(甲基氨磺酰基)苯基-
3.743	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-氨磺酰基苯基-
3.744	-CH <sub>2</sub> -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-氨基甲酰基苯基-

[0341] 表C-2提供了744种具有式(I)的化合物C-2.001至C-2.744,其中G是-H,W是(E)-CH=CH-,Y是3-环丙基,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、X、Y和D是如上表3中分别对于化合物编号3.001至3.744所定义的。

[0342] 表C-3提供了744种具有式(I)的化合物C-3.001至C-3.744,其中G是-(C=O) iPr,W是-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-,Y是3-环丙基,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、X和D是如上表3中分别对于化合物编号3.001至3.744所定义的。

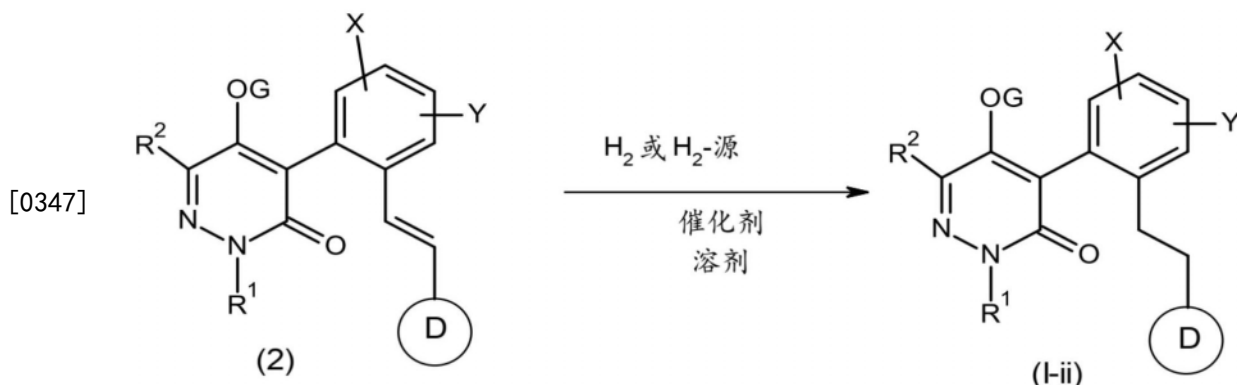
[0343] 表C-4提供了744种具有式(I)的化合物C-4.001至C-4.744,其中G是-(C=O) iPr,W是(E)-CH=CH-,Y是3-环丙基,并且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、X和D是如上表3中分别对于化合物编号3.001至3.744所定义的。

[0344] 本发明的化合物可以根据以下方案制备,其中取代基R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、R<sup>14</sup>、R<sup>15</sup>、R<sup>16</sup>、W、D、Dp、G、X、Y和m具有(除非另外明确说明)在上文中所述的定义。

[0345] 如在反应方案1中所示,可以由化合物(2)制备本发明的某些化合物(I-ii)。化合

物(I-ii)是具有式(I)的化合物,其中W是 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 。

[0346] 反应方案1



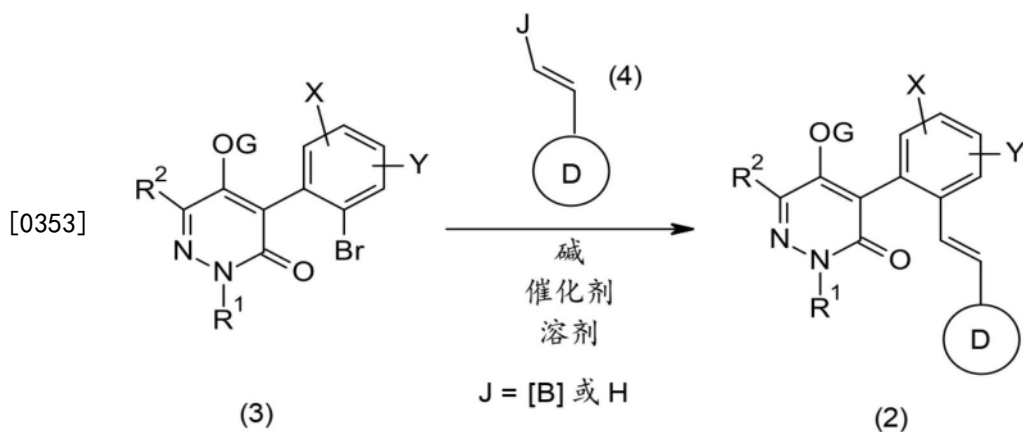
[0348] 化合物(I-ii)可以通过化合物(2)与氢气在合适的溶剂[如四氢呋喃、甲醇、乙醇、乙酸或乙酸乙酯]中在合适的催化剂[如Pd/C、Pd/CaCO<sub>3</sub>、Rh/Al<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>或海绵镍]存在下在-10°C与100°C之间的温度下的催化氢化来制备。

[0349] 可替代地,化合物(I-ii)还可以通过合适的溶剂中在合适的催化剂存在下在-10°C与100°C之间的温度下用合适的氢源处理通过化合物(2)的催化转移氢化来制备。合适的体系的实例是在Pd/C、Pd(OAc)<sub>2</sub>或Pd(OH)<sub>2</sub>/C存在下在二氯甲烷/水或二氯甲烷/甲醇混合物中的四羟基二硼(J. Am. Chem. Soc. [美国化学会志], 2016, 138, 6107-6110)或在Pd/C存在下在乙醇中的1,4-二氢-2,6-二甲基-3,5-吡啶二甲酸二乙酯(Tetrahedron Letters [四面体通讯], 2009, 50, 1026)。

[0350] 如在反应方案2中所示,化合物(2)可以由化合物(3)和化合物(4)根据以下所述的铃木协议(Suzuki Protocol)或赫克协议(Heck Protocol)来制备。当采用铃木协议时,化合物(4)是有机硼化合物,如硼酸、硼酸酯或三氟硼酸钾盐。当采用赫克协议时,化合物(4)是苯乙烯。

[0351] 可替代地,化合物(I-ii)还可以通过用由合适的前体原位生成的二酰亚胺在合适的溶剂中在-10°C与200°C之间的温度下还原制备。用于生成二酰亚胺的合适的试剂的实例包括任选地在合适的碱存在下经取代的芳基磺酰基酰肼,如2,4,6-三异丙基苯磺酰基酰肼。合适的碱的实例包括三乙胺、二异丙基乙胺、碳酸钾和碳酸钠。合适的溶剂包括四氢呋喃、1,4-二噁烷、乙酸乙酯、乙腈和二甲基甲酰胺。

[0352] 反应方案2



## [0354] 铃木协议

[0355] 化合物(2)可以通过在合适的碱和合适的催化剂存在下在合适的溶剂中在10°C与150°C之间的温度下用化合物(4)处理化合物(3)来制备。合适的碱的实例包括碳酸钾、磷酸钾、碳酸钠、碳酸氢钠和氟化钾。合适的催化剂的实例包括1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯(II)二氯甲烷络合物[PdCl<sub>2</sub>(dppf)·DCM]、四(三苯基膦)钯(0)[Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>]、以及由乙酸钯(II)和三苯基膦的混合物原位形成的催化体系。合适的溶剂的实例包括水、1,4-二噁烷、四氢呋喃、乙腈和甲苯。许多化合物(4)是可商购的[例如,反式-2-(4-联苯基)乙烯基硼酸]或者可以通过已知的方法制得。在铃木协议中具有特定效用的化合物(3)的实例是异丁酰酯(3-i),其中G是异丁酰基。

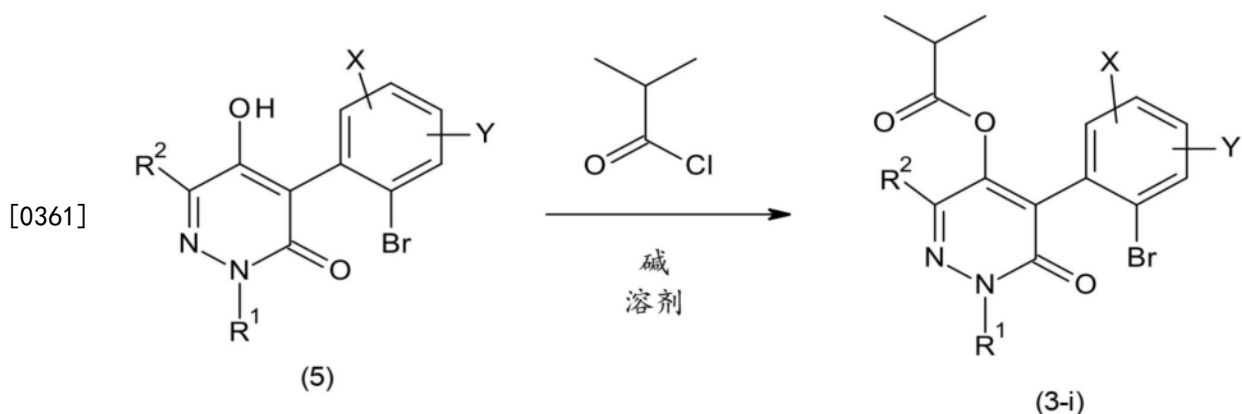
[0356] 技术人员将理解,铃木协议的条件易于裂解酯基,使得反应方案2也可以描述以下反应,在所述反应中起始材料(3)含有酯部分[使得G为酰基],但产物(2)不含[使得G为氢]。

## [0357] 赫克协议

[0358] 化合物(2)可以通过在合适的碱和合适的催化剂存在下在10°C与150°C之间的温度下用化合物(4)处理化合物(3)来制备。可以任选地包括额外的溶剂。合适的碱的实例包括三乙胺、吗啉、N-甲基吗啉、二异丙基乙胺和吡啶。合适的催化剂的实例包括四(三苯基膦)钯(0)[Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>]、由乙酸钯(II)和三苯基膦的混合物原位形成的催化体系、由三(二亚苺基丙酮)二钯(0)和三叔丁基膦四氟硼酸盐的混合物原位形成的催化体系以及由环钯配合物预催化剂如氯[(三叔丁基膦)-2-(2-氨基联苯基)]钯(II)原位形成的催化体系。任选的额外的溶剂的实例包括1,4-二噁烷、四氢呋喃、乙腈和甲苯。许多化合物(4)是可商购的[如4-氰基苯乙烯]或者可以通过已知的方法制得。在赫克协议中具有特定效用的化合物(3)的实例是异丁酰酯(3-i),其中G是异丁酰基。

[0359] 如在反应方案3中所示,可以由化合物(5)制备化合物(3-i)。

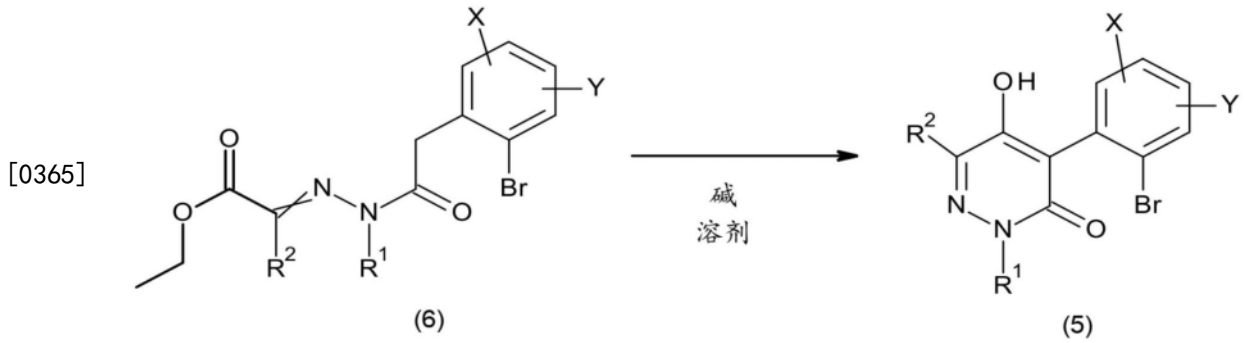
## [0360] 反应方案3



[0362] 化合物(3-i)可以通过在合适的溶剂[如二氯甲烷、乙腈或甲苯]中在合适的碱[如三乙胺、二异丙基乙胺或吡啶]存在下在-10°C与60°C之间的温度下用异丁酰氯处理化合物(5)来制备。可以任选地包括催化剂[如4-(二甲基氨基)吡啶]。

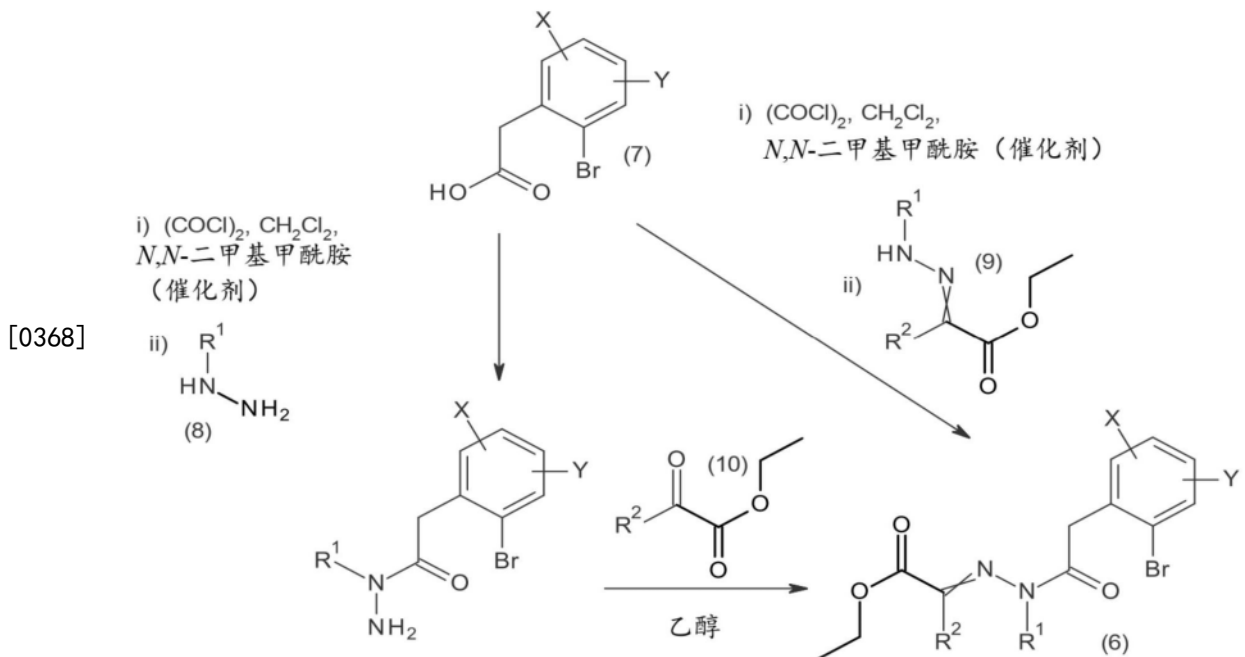
[0363] 如在反应方案4中所示,化合物(5)可以由化合物(6)通过在溶剂[如乙腈、N,N-二甲基甲酰胺或甲苯]中在50°C与200°C之间的温度下加热化合物(6)与碱(如1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯、六甲基二硅氮烷钠或六甲基二硅氮烷锂)来制备。可以使用常规加热或微波加热。

## [0364] 反应方案4



[0366] 如在反应方案5中所示,化合物(6)可以由苯乙酸(7)制备。

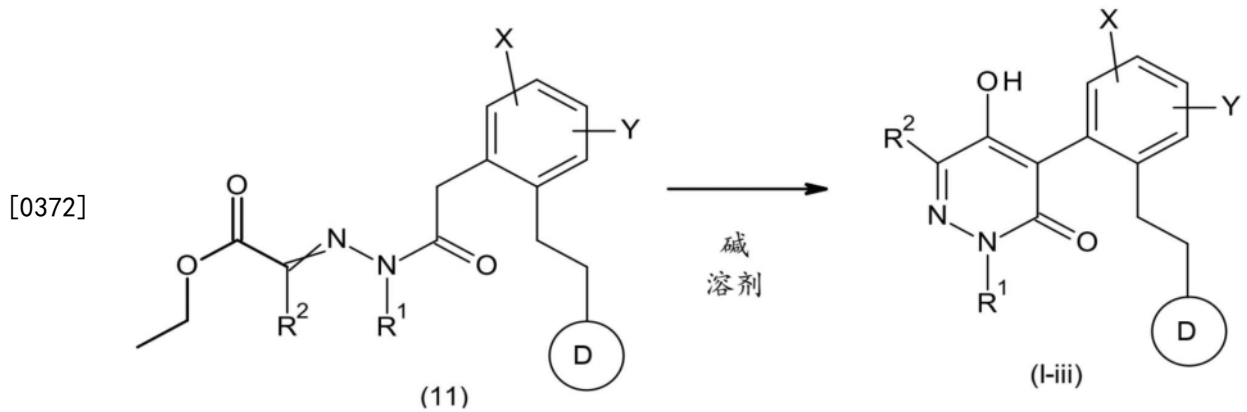
## [0367] 反应方案5



[0369] 关于反应方案5,肼(8)的实例是甲基肼,并且酮酯(10)的实例是丙酮酸乙酯。脒(9)的实例是(2E/Z)-2-(甲基胍叉)丙酸乙酯,根据PCT专利申请W0 2016/008816中描述的方法制备。苯乙酸(7)的实例是(2-溴-6-氟-苯基)乙酸,其可以根据反应方案10来合成。苯乙酸(7)的另外的实例是(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)乙酸,其可以根据反应方案11来合成。

[0370] 本发明的某些化合物(I-iii)可以由化合物(11)(如在反应方案6中所示)或化合物(I-iv)(如在反应方案12中所示)制备。化合物(I-iii)是具有式(I)的化合物,其中W是-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-并且G是氢。

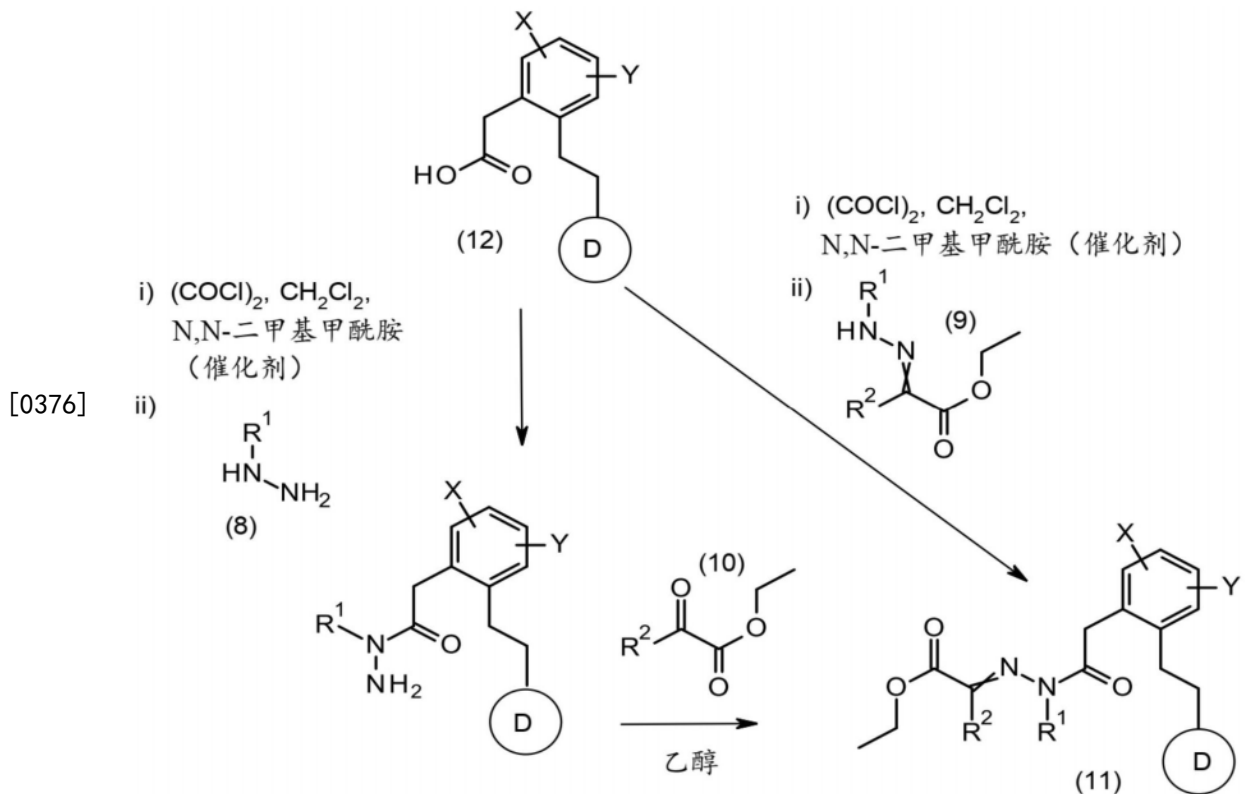
## [0371] 反应方案6



[0373] 化合物 (I-iii) 可以通过在溶剂[如乙腈、N,N-二甲基甲酰胺或甲苯]中在50℃与200℃之间的温度下加热化合物 (11) 与碱(如1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯、六甲基二硅氮烷钠或六甲基二硅氮烷锂)来制备。可以使用常规加热或微波加热。

[0374] 如在以下反应方案7中所示,可以由化合物 (12) 制备化合物 (11)。

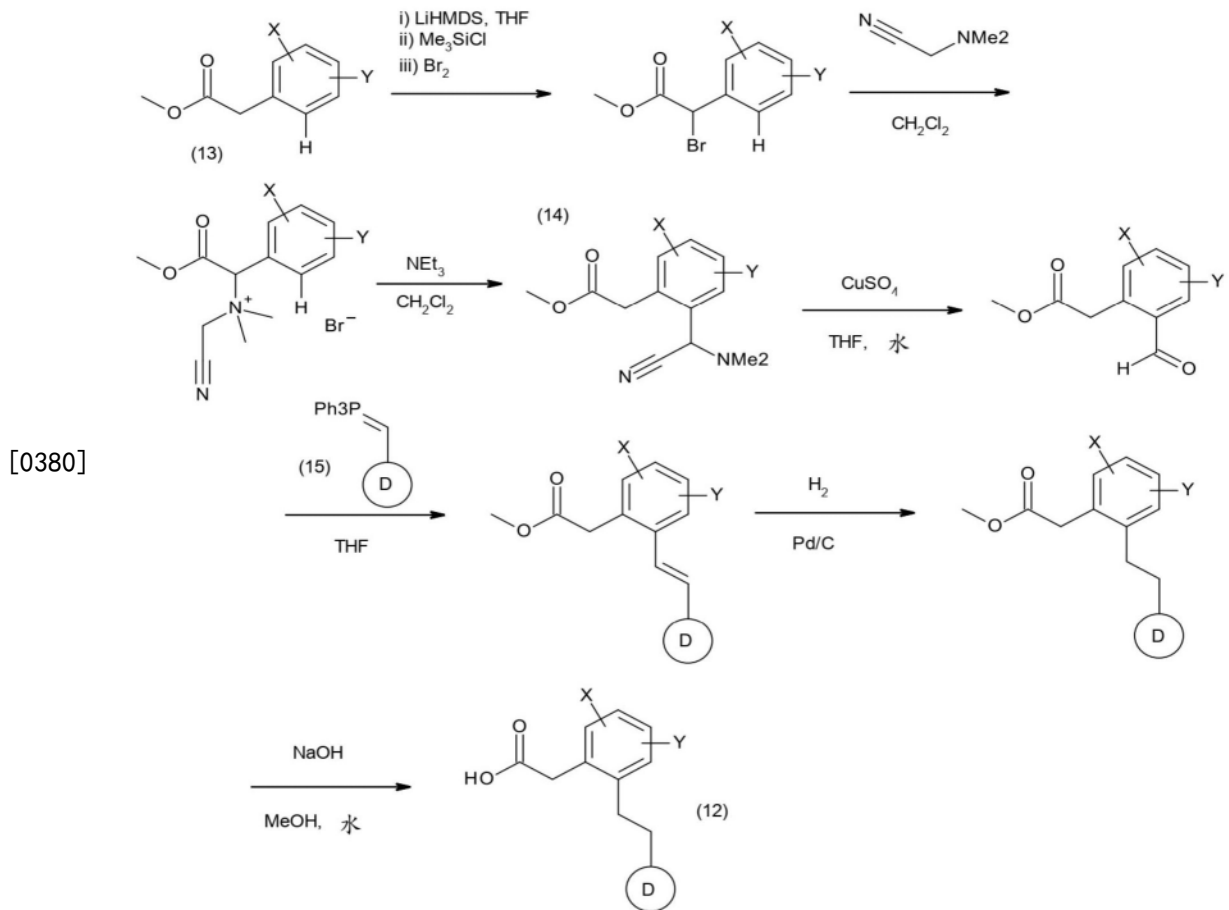
[0375] 反应方案7



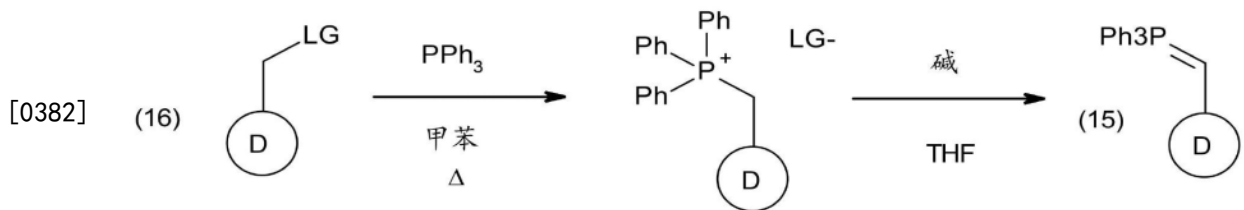
[0377] 如在反应方案8中所示,可以由化合物 (13) 制备化合物 (12)。许多化合物 (13) 是可商购的[如2-苯基乙酸甲酯和2-(2-氟苯基)乙酸甲酯]。

[0378] 关于反应方案8,可以根据反应方案9来制备正膦 (15)。

[0379] 反应方案8

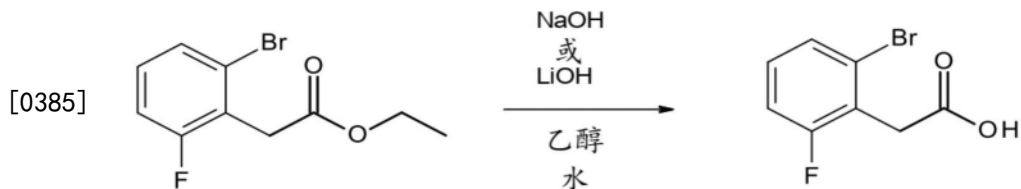


[0381] 反应方案9



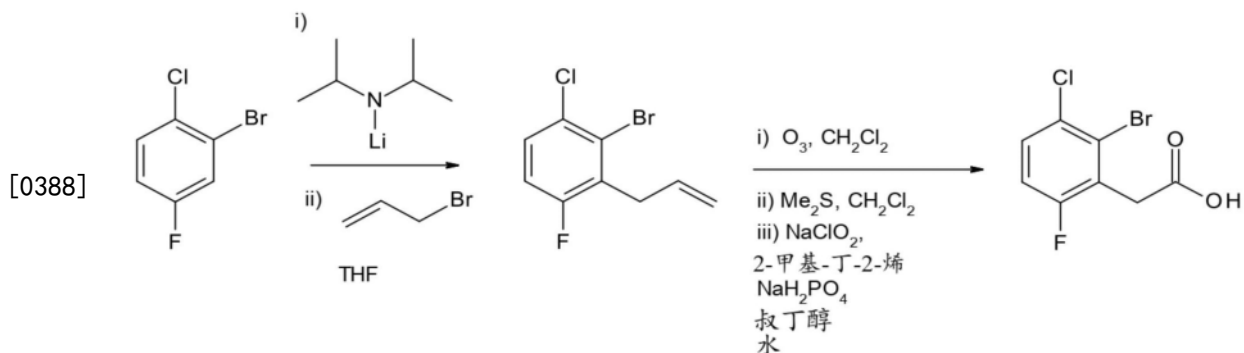
[0383] 关于反应方案9,合适的碱的实例是氢氧化钠、六甲基二硅氮烷钠和叔丁醇钾。化合物(16)是亲电体,其中LG是离去基团[如氯化物、溴化物、碘化物、甲苯磺酸酯或甲磺酸酯]。许多化合物(16)是可商购的[如4-氯苄基溴或2-氯-5-氯甲基噻唑]。

[0384] 反应方案10



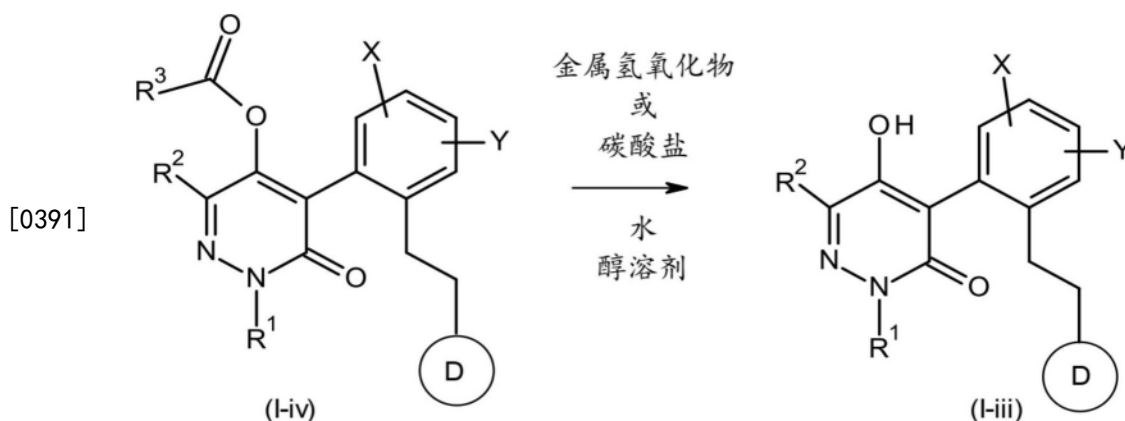
[0386] 关于反应方案10,可以如Lundgren等人JACS 2016, 138, 13826-13829中所述的制备(2-溴-6-氟-苯基)乙酸乙基酯。

[0387] 反应方案11



[0389] 关于反应方案11, 2-溴-1-氯-4-氟-苯是可商购的。

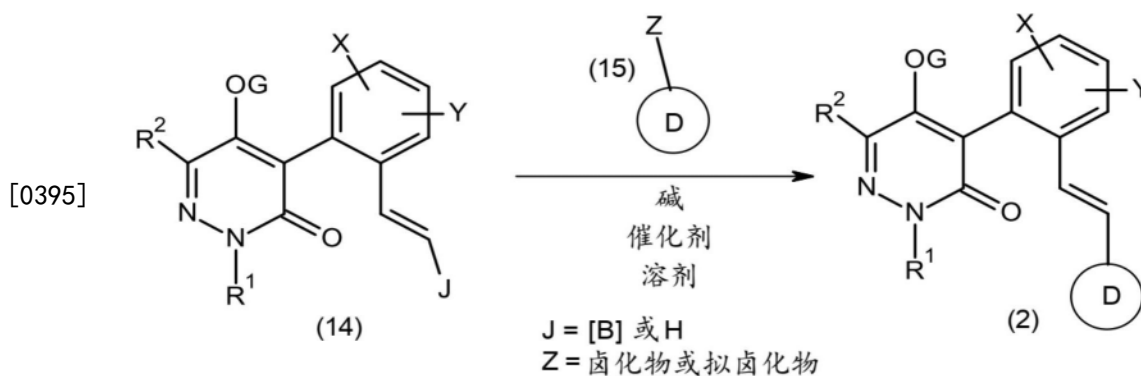
[0390] 反应方案12



[0392] 化合物 (I-iii) 可以通过以下方式制备: 在水和合适的溶剂[如甲醇、乙醇或四氢呋喃]的混合物中用金属氢氧化物[如氢氧化钠、氢氧化锂或氢氧化钾]处理化合物 (I-iv); 或在 $0^\circ\text{C}$ 与 $100^\circ\text{C}$ 之间的温度下在醇溶剂[如甲醇或乙醇]中用金属碳酸盐[如碳酸钠或碳酸钾]处理化合物 (I-iv)。化合物 (I-iv) 是具有式 (I) 的化合物, 其中W是 $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 并且G是C(O) $\text{R}^3$ 。

[0393] 如在反应方案13中所示, 化合物 (2) 可以由化合物 (14) 和化合物 (15) 根据以下所述的铃木协议或赫克协议来制备。当采用铃木协议时, 化合物 (14) 是有机硼化合物, 如硼酸、硼酸酯或三氟硼酸钾盐并且化合物 (15) 是卤化物或拟卤化物化合物, 如氯化物、溴化物、碘化物或三氟甲磺酸盐。当采用赫克协议时, 化合物 (14) 是苯乙烯并且化合物 (15) 是卤化物或拟卤化物化合物, 如氯化物、溴化物、碘化物或三氟甲磺酸盐。

[0394] 反应方案13



[0396] 铃木协议

[0397] 化合物(2)可以通过在合适的碱和合适的催化剂存在下在合适的溶剂中在10°C与150°C之间的温度下用化合物(15)处理化合物(14)来制备。合适的碱的实例包括碳酸钾、磷酸钾、碳酸钠、碳酸氢钠和氟化钾。合适的催化剂的实例包括1,1'-双(二苯基膦)二茂铁]二氯化钯(II)二氯甲烷络合物[PdCl<sub>2</sub>(dppf)·DCM]、四(三苯基膦)钯(0)[Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>]、以及由乙酸钯(II)和三苯基膦的混合物原位形成的催化体系。合适的溶剂的实例包括水、1,4-二噁烷、四氢呋喃、乙腈和甲苯。许多化合物(15)是可商购的或者可以通过已知的方法制得。在铃木协议中具有特定效用的化合物(14)的实例是异丁酰酯(14-i),其中G是异丁酰基。

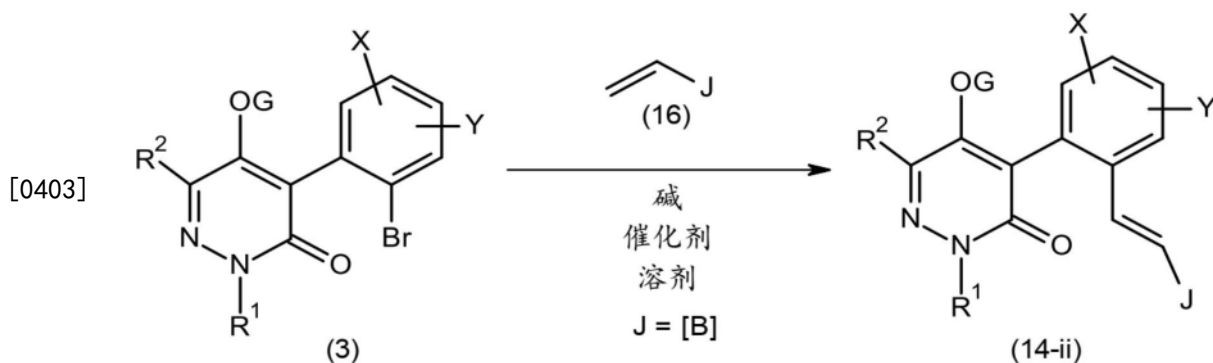
[0398] 技术人员将理解,铃木协议的条件易于裂解酯基,使得反应方案13也可以描述以下反应,在所述反应中起始材料(14)含有酯部分[使得G为酰基],但产物(2)不含[使得G为氢]。

#### [0399] 赫克协议

[0400] 化合物(2)可以通过在合适的碱和合适的催化剂存在下在10°C与150°C之间的温度下用化合物(15)处理化合物(14)来制备。可以任选地包括额外的溶剂。合适的碱的实例包括三乙胺、吗啉、N-甲基吗啉、二异丙基乙胺和吡啶。合适的催化剂的实例包括四(三苯基膦)钯(0)[Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>]、由乙酸钯(II)和三苯基膦的混合物原位形成的催化体系、由三(二亚苄基丙酮)二钯(0)和三叔丁基膦四氟硼酸盐的混合物原位形成的催化体系以及由环钯配合物预催化剂如氯[三叔丁基膦]-2-(2-氨基联苯基)钯(II)原位形成的催化体系。任选的额外的溶剂的实例包括1,4-二噁烷、四氢呋喃、乙腈和甲苯。许多化合物(15)是可商购的或者可以通过已知的方法制得。在赫克协议中具有特定效用的化合物(14)的实例是异丁酰酯(14-i),其中G是异丁酰基。

[0401] 如在反应方案14中所示,可以由化合物(3)和化合物(16)制备化合物(14-ii),其中J是有机硼物种,如硼酸酯。

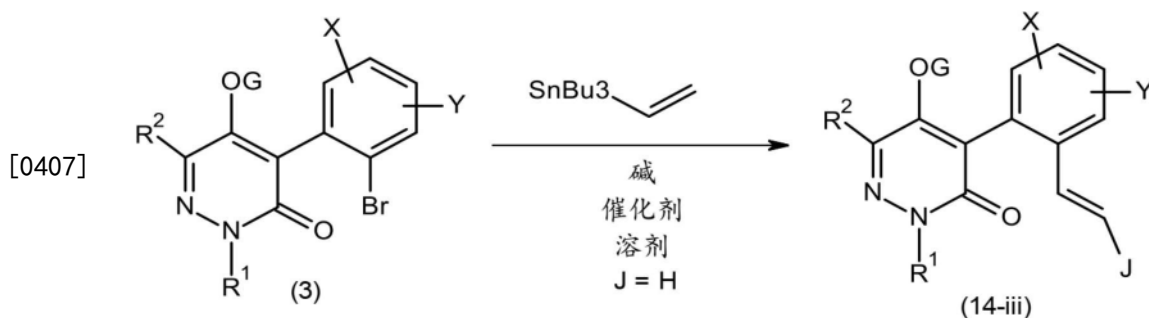
#### [0402] 反应方案14



[0404] 化合物(14-ii)可以通过在合适的碱和合适的催化剂存在下在10°C与150°C之间的温度下用化合物(16)处理化合物(3)来制备。可以任选地包括额外的溶剂。合适的碱的实例包括三乙胺、吗啉、N-甲基吗啉、二异丙基乙胺和吡啶。合适的催化剂的实例是四(三苯基膦)钯(0)[Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>]、由乙酸钯(II)和三苯基膦的混合物原位形成的催化体系和由三(二亚苄基丙酮)二钯(0)和三叔丁基膦四氟硼酸盐的混合物原位形成的催化体系。任选的额外的溶剂的实例包括1,4-二噁烷、四氢呋喃、乙腈和甲苯。许多化合物(16)是可商购的,如乙烯基硼酸MIDA酯或乙烯基硼酸频哪醇酯,或者可以通过已知的方法制得。在赫克协议中具有特定效用的化合物(3)的实例是异丁酰酯(3-i),其中G是异丁酰基。

[0405] 如在反应方案15中所示,可以由化合物(3)制备化合物(14-iii)(其中J是氢)。

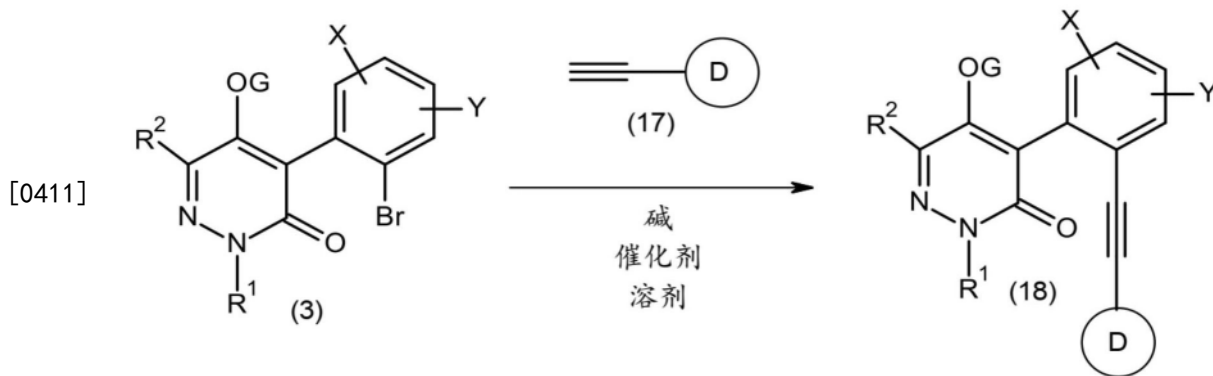
[0406] 反应方案15



[0408] 化合物(14-iii)可以通过任选地在合适的碱存在下,在合适的催化剂存在下,在10°C与150°C之间的温度下在合适的溶剂中用三丁基(乙烯基)锡烷处理化合物(3)来制备。任选的碱的实例包括三乙胺、吗啉、N-甲基吗啉、二异丙基乙胺和吡啶。合适的催化剂的实例包括1,1'-双(二苯基膦基)-二茂铁]二氯化钯(II)二氯甲烷络合物[PdCl<sub>2</sub>(dppf)·DCM]、四(三苯基膦)钯(0)[Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>]、由乙酸钯(II)和三苯基膦的混合物原位形成的催化体系、由三(二亚苄基丙酮)二钯(0)和三叔丁基膦四氟硼酸盐的混合物原位形成的催化体系以及由环钯配合物预催化剂如氯[(三叔丁基膦)-2-(2-氨基联苯基)]钯(II)原位形成的催化体系。合适的溶剂的实例包括1,4-二噁烷、四氢呋喃、乙腈和甲苯。具有特定效用的化合物(3)的实例是异丁酰酯(3-i),其中G是异丁酰基。

[0409] 如在反应方案16中所示,可以由化合物(3)通过菌头(Sonogashira)反应制备化合物(18)。

[0410] 反应方案16



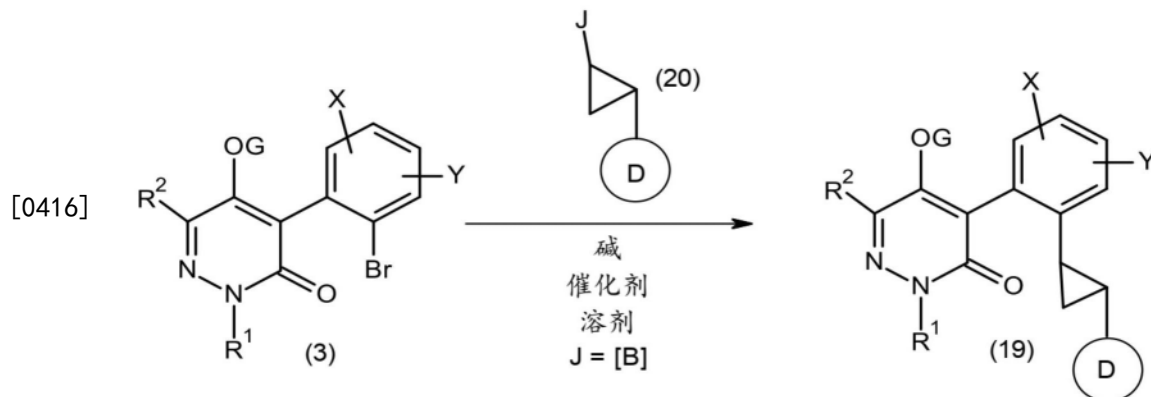
[0412] 化合物(18)可以通过在合适的碱和一种或多种合适的催化剂存在下在10°C与150°C之间的温度下用化合物(17)处理化合物(3)来制备。任选地,可以添加额外的溶剂。合适的碱的实例包括三乙胺、吗啉、N-甲基吗啉、二异丙基乙胺、二异丙基乙胺和吡啶。合适的催化剂的实例包括双(三苯基膦)钯(II)二氯化物[Pd(PPh<sub>3</sub>)Cl<sub>2</sub>]、由乙酸钯(II)和三苯基膦的混合物原位形成的催化体系、由三(二亚苄基丙酮)二钯(0)和三叔丁基膦四氟硼酸盐的混合物原位形成的催化体系以及由环钯配合物预催化剂如氯[(三叔丁基膦)-2-(2-氨基联苯基)]钯(II)原位形成的催化体系。任选地还可以添加铜催化剂,如碘化铜(I)。合适的额外的溶剂的实例是1,4-二噁烷、四氢呋喃、乙腈、甲苯和N,N-二甲基甲酰胺。具有特定效用的化合物(3)的实例是异丁酰酯(3-i),其中G是异丁酰基。

[0413] 技术人员将理解,菌头反应的条件易于裂解酯基,使得反应方案16也可以描述以

下反应,在所述反应中起始材料(3)含有酯部分[使得G为酰基],但产物(18)不含[使得G为氢]。

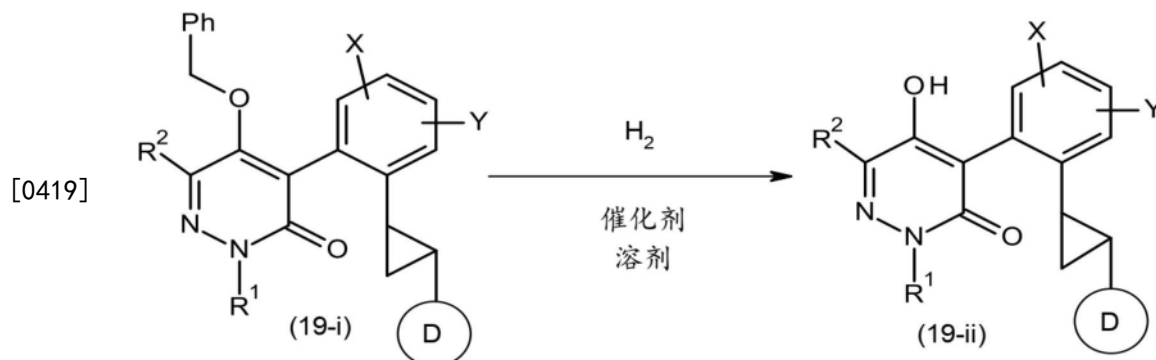
[0414] 如在反应方案17中所示,化合物(19)可以由化合物(3)和化合物(20)通过铃木反应制备,其中化合物(20)是合适的有机硼物种,如硼酸、硼酸酯或三氟硼酸钾盐。

[0415] 反应方案17



[0417] 化合物(19)可以通过在合适的碱和合适的催化剂存在下在合适的溶剂中在10°C与150°C之间的温度下用化合物(20)处理化合物(3)来制备。合适的碱的实例包括碳酸钾、磷酸钾、碳酸钠、碳酸氢钠和氟化钾。合适的催化剂的实例包括1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁二氯化钯(II)二氯甲烷络合物[PdCl<sub>2</sub>(dppf).DCM]、由三(二亚苄基丙酮)二钯(0)和三叔丁基膦四氟硼酸盐的混合物原位形成的催化体系、由三(二亚苄基丙酮)二钯(0)和三环己基膦的混合物原位形成的催化体系、由环钯配合物预催化剂如氯[(三叔丁基膦)-2-(2-氨基联苯基)]钯(II)原位形成的催化体系、以及由环钯配合物预催化剂如氯[(三环己基膦)-2-(2'-氨基联苯基)]钯(II)原位形成的催化体系。合适的溶剂的实例包括水、1,4-二噁烷、四氢呋喃、乙腈和甲苯。一些化合物(20)是可商购的[如4,4,5,5-四甲基-2-(2-苯基-环丙基)-[1,3,2]二氧杂环戊硼烷]或者可以通过已知的方法制得(参见例如Org. Process Res. Dev. [有机过程研究与发展], 2012, 16, 87-95中描述的方法)。在铃木反应中具有特定效用的化合物(3)的实例是苄基醚(3-ii),其中G是苄基。

[0418] 反应方案18

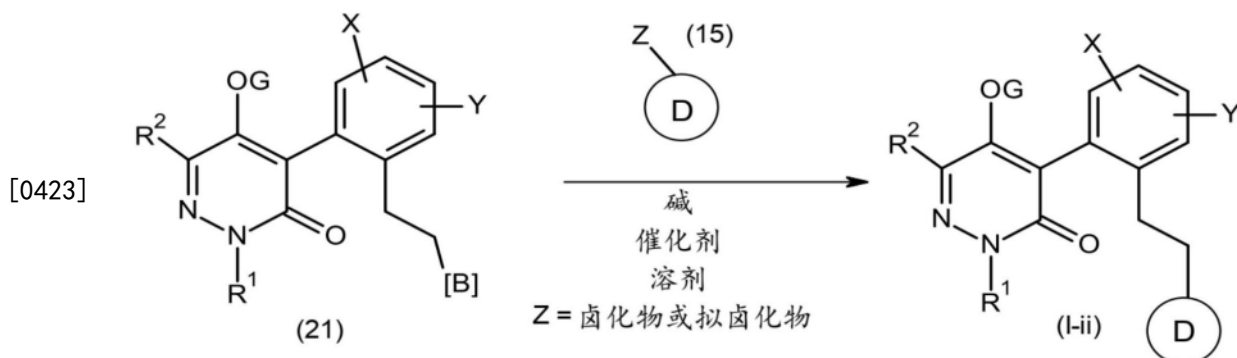


[0420] 化合物(19-ii)可以通过化合物(19-i)与氢气在合适的溶剂[如四氢呋喃、甲醇、乙醇、乙酸或乙酸乙酯]中在合适的催化剂[如Pd/C、Pd/CaCO<sub>3</sub>、Rh/Al<sub>2</sub>O<sub>3</sub>或海绵镍]存在下在-10°C与100°C之间的温度下的催化氢化来制备。

[0421] 如在反应方案19中所示,可以由化合物(21)制备本发明的某些化合物(I-ii)。化

合物 (I-ii) 是具有式 (I) 的化合物, 其中 W 是  $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ 。

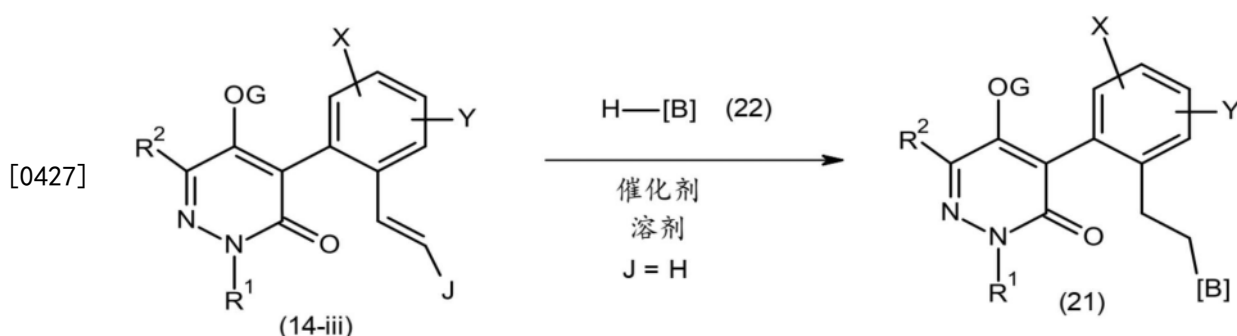
[0422] 反应方案19



[0424] 化合物 (I-ii) 可以通过在合适的碱和合适的催化剂存在下在合适的溶剂中在  $10^\circ\text{C}$  与  $150^\circ\text{C}$  之间的温度下用化合物 (15) 处理化合物 (21) (其中 [B] 可以是三烷基硼烷、烷基硼酸、烷基硼酸酯或烷基三氟硼酸钾盐) 来制备。合适的碱的实例包括碳酸钾、磷酸钾、碳酸钠、碳酸铯、碳酸氢钠和氟化钾。合适的催化剂的实例包括 1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁]-二氯钯 (II) 二氯甲烷络合物  $[\text{PdCl}_2(\text{dppf})\cdot\text{DCM}]$ 、[1,3-双(2,6-二-3-戊基苯基)咪唑-2-亚基](3-氯吡啶基)二氯钯 (II)  $[\text{Pd-PEPPSI}^{\text{TM}}\text{-IPent}]$ 、由环钯配合物预催化剂如氯(2-二环己基膦基-2',6'-二异丙氧基-1,1'-联苯基)[2-(2'-氨基-1,1'-联苯基)]钯 (II)  $[\text{RuPhos-Pd-G2}]$  原位形成的催化体系、[二环己基[2',4',6'-三(1-甲基乙基)[1,1'-联苯基]-2-基]膦(甲烷磺酸基- $\kappa\text{O}$ )[2'-(甲基氨基- $\kappa\text{N}$ )[1,1'-联苯基]-2-基- $\kappa\text{C}$ ]钯  $[\text{XPhos-Pd-G4}]$ 、以及 [(4-(N,N-二甲基氨基)苯基)二-叔丁基膦(甲烷磺酸基- $\kappa\text{O}$ )[2'-(甲基氨基- $\kappa\text{N}$ )[1,1'-联苯基]-2-基- $\kappa\text{C}$ ]钯  $[\text{APhos-Pd-G4}]$ 。合适的溶剂的实例包括水、1,4-二噁烷、四氢呋喃、乙腈和甲苯。许多化合物 (15) 是可商购的或者可以通过已知的方法制得。在铃木协议中具有特定效用的化合物 (21) 的实例是异丁酯 (21-i), 其中 G 是异丁酰基。

[0425] 技术人员将理解, 铃木协议的条件易于裂解酯基, 使得反应方案 19 也可以描述以下反应, 在所述反应中起始材料 (21) 含有酯部分 [使得 G 为酰基], 但产物 (I-ii) 不含 [使得 G 为氢]。

[0426] 反应方案20

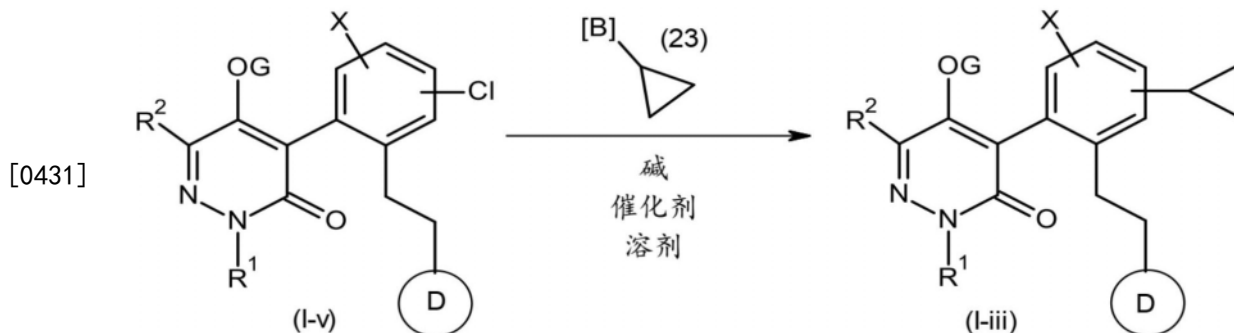


[0428] 化合物 (21) 可以通过在合适的溶剂中任选地添加合适的催化剂的情况下在  $0^\circ\text{C}$  与  $100^\circ\text{C}$  之间的温度下使用合适的硼氢化试剂 (22) 进行烯烃 (14-iii) 的硼氢化来制备。硼氢化试剂的实例包括硼烷、二氯硼烷、二溴硼烷、4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷 [频哪醇硼烷]、1,3,2-苯并二氧杂戊硼烷 [儿茶酚硼烷] 或 9-硼基双环[3.3.1]壬烷 [9-BBN]。合适的溶剂的实例包括四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃、1,4-二噁烷、2-甲氧基-2-甲基-丙烷

[MTBE) 和二乙醚。合适的催化剂的实例包括由双(1,5-环辛二烯)二铱(I)二氯化物[[Ir(COD)Cl]<sub>2</sub>]原位形成的催化体系、和4-二苯基磷烷基丁基(二苯基)磷烷[DPPB][J. Am. Chem. Soc. [美国化学会志], 2004, 126, 9200-9201]。

[0429] 在[B]是烷基硼酸酯时,这可以通过在合适的溶剂如二氯甲烷[DCM]中在0°C与40°C之间的温度下用甲基硼酸[MeB(OH)<sub>2</sub>]和三氟乙酸处理而转化为相应的硼酸[Org. Lett. [有机快报], 2019, 21, 3048-3052]。在[B]是烷基硼酸或酯时,这可以通过在合适的溶剂如甲醇或丙酮中在0°C与40°C之间的温度下用氟氢化钾处理而转化为相应的烷基三氟硼酸钾盐。

[0430] 反应方案21



[0432] 化合物(I-iii) (其中Y是环丙基)可以通过在合适的碱和合适的催化剂存在下在合适的溶剂中在10°C与150°C之间的温度下用化合物(23) (其中[B]可以是三烷基硼烷、烷基硼酸、烷基硼酸酯或烷基三氟硼酸钾盐)处理化合物(I-v)来制备。化合物(I-v)是具有式(I)的化合物,其中C是-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-,G是C(o)R<sup>3</sup>并且Y是-Cl。合适的碱的实例包括碳酸钾、磷酸钾、碳酸钠、碳酸铯、碳酸氢钠和氟化钾。合适的催化剂的实例包括1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁-二氯钯(II)二氯甲烷络合物[PdCl<sub>2</sub>(dppf)·DCM]、[1,3-双(2,6-二-3-戊基苯基)咪唑-2-亚基](3-氯吡啶基)二氯钯(II)[Pd-PEPPSI<sup>TM</sup>-IPent]、由环钯配合物预催化剂如氯(2-二环己基膦基-2',6'-二异丙氧基-1,1'-联苯基)[2-(2'-氨基-1,1'-联苯基)]钯(II)[RuPhos-Pd-G2]原位形成的催化体系、[二环己基[2',4',6'-三(1-甲基乙基)[1,1'-联苯基]-2-基]膦(甲烷磺酸基-κO)[2'-(甲基氨基-κN)[1,1'-联苯基]-2-基-κC]钯[XPhos-Pd-G4]、以及[(4-(N,N-二甲基氨基)苯基)二-叔丁基膦(甲烷磺酸基-κO)[2'-(甲基氨基-κN)[1,1'-联苯基]-2-基-κC]钯[APhos-Pd-G4]。合适的溶剂的实例包括水、1,4-二噁烷、四氢呋喃、乙腈和甲苯。在铃木协议中具有特定效用的化合物(I-v)的实例是异丁酰酯(I-v),其中G是异丁酰基。

[0433] 技术人员将理解,铃木协议的条件易于裂解酯基,使得反应方案21可以描述以下反应,在所述反应中起始材料(I-v)含有酯部分[使得G为酰基],但产物(I-iii)不含[使得G为氢]。

[0434] 根据本发明的具有式(I)的化合物可以自身被用作除草剂,但是通常使用配制辅助剂(如载体、溶剂和表面活性剂(SFA))将它们配制成除草组合物。因此,本发明进一步提供了一种除草组合物,所述除草组合物包含根据前述权利要求中任一项所述的除草化合物和农业上可接受的配制辅助剂。所述组合物可以处于浓缩物的形式,在使用前稀释这些浓缩物,尽管也可以制成即用型组合物。通常用水进行最终稀释,但是可以替代水或除了水之外使用例如液体肥料、微量营养素、生物有机体、油或溶剂。

[0435] 所述除草组合物总体上包含按重量计从0.1%至99%、尤其是按重量计从0.1%至95%的具有式I的化合物和按重量计从1%至99.9%的配制辅助剂,所述配制辅助剂优选地包括按重量计从0至25%的表面活性物质。

[0436] 这些组合物可以选自多种配制品类型,这些配制品类型中的很多是从Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products[关于植物保护产物的FAO标准的发展和用手册],第5版,1999年中得知。这些包括可尘化粉剂(DP)、可溶性粉剂(SP)、水溶性颗粒剂(SG)、水可分散性颗粒剂(WG)、可湿性粉剂(WP)、颗粒剂(GR)(缓释或快释的)、可溶的浓缩物(SL)、油易混合的液体(OL)、超低体积液体(UL)、可乳化的浓缩物(EC)、可分散性浓缩物(DC)、乳液(水包油(EW)和油包水(EO)二者)、微乳液(ME)、悬浮液浓缩物(SC)、气溶胶、胶囊悬浮液(CS)以及种子处理配制品。在任何情况下,所选择的配制品类型将取决于所设想的具体目的以及具有式(I)的化合物的物理、化学和生物特性。

[0437] 可尘化粉剂(DP)可以通过将具有式(I)的化合物与一种或多种固体稀释剂(例如,天然粘土、高岭土、叶蜡石、膨润土、氧化铝、蒙脱石、硅藻土(kieselguhr)、白垩土、硅藻土(diatomaceous earths)、磷酸钙、碳酸钙和碳酸镁、硫、石灰、面粉、滑石和其他有机和无机的固体载体)混合并将所述混合物机械地碾磨成细粉末来制备。

[0438] 可溶性粉剂(SP)可以通过以下方式制备:将具有式(I)的化合物与一种或多种水溶性无机盐(如碳酸氢钠、碳酸钠或硫酸镁)或一种或多种水溶性有机固体(如多糖)以及任选地一种或多种湿润剂、一种或多种分散剂或所述试剂的混合物进行混合,以改进水分散性/水溶性。然后将所述混合物研磨成细粉末。也可以将类似的组合物颗粒化以形成水溶性颗粒剂(SG)。

[0439] 可湿性粉剂(WP)可以通过将具有式(I)的化合物与一种或多种固体稀释剂或载体、一种或多种湿润剂以及优选地,一种或多种分散剂,以及任选地,一种或多种悬浮剂混合来制备以促进在液体中的分散。然后将所述混合物研磨成细粉末。也可以将类似的组合物颗粒化以形成水可分散性颗粒剂(WG)。

[0440] 可以这样形成颗粒剂(GR):通过将具有式(I)的化合物与一种或多种粉状固体稀释剂或载体的混合物造粒来形成,或者通过将具有式(I)的化合物(或其在合适的试剂中的溶液)吸收进多孔颗粒材料(如浮石、凹凸棒石粘土、漂白土、硅藻土(kieselguhr)、硅藻土(diatomaceous earths)或玉米芯粉),或通过将具有式(I)的化合物(或其在合适的试剂中的溶液)吸附到硬芯材料(如沙、硅酸盐、矿物碳酸盐、硫酸盐或磷酸盐)上并且如果必要的话,进行干燥来由预成型的空白颗粒形成。通常用于帮助吸收或吸附的试剂包括溶剂(如脂肪族和芳香族石油溶剂、醇、醚、酮以及酯)和粘着剂(如聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇、糊精、糖以及植物油)。一种或多种其他添加剂还可以被包含在颗粒剂(例如乳化剂、湿润剂或分散剂)中。

[0441] 可分散的浓缩物(DC)可以通过将具有式(I)的化合物溶于水或有机溶剂(如酮、醇或乙二醇醚)中来制备。这些溶液可以包含表面活性剂(例如以改进水稀释或防止喷雾罐中的结晶)。

[0442] 可乳化性浓缩物(EC)或水包油乳液(EW)可以通过将具有式(I)的化合物溶于有机溶剂(任选地包含一种或多种湿润剂、一种或多种乳化剂或者所述试剂的混合物)中来制

备。在EC中使用的合适的有机溶剂包括芳香族烃(如烷基苯或烷基萘,例如SOLVESSO 100、SOLVESSO 150和SOLVESSO 200;SOLVESSO是注册商标)、酮类(如环己酮或甲基环己酮)和醇类(如苯甲醇、糠醇或丁醇)、N-烷基吡咯烷酮类(如N-甲基吡咯烷酮或N-辛基吡咯烷酮)、脂肪酸的二甲基酰胺(如C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>脂肪酸二甲基酰胺)和氯化烃。EC产品可以在添加到水中时自发地乳化,从而产生具有足够稳定性的乳液,以允许通过适当设备进行喷洒施用。

[0443] EW的制备涉及获得作为液体(如果它在室温下不是液体,则它可以在典型地低于70°C的合理温度下融化)或处于溶液中(通过将它溶于适当的溶剂中)的具有式(I)的化合物,并且然后在高剪切下将所得液体或溶液乳化到包含一种或多种SFA的水中,以产生乳液。在EW中使用的合适的溶剂包括植物油、氯化烃(如氯苯)、芳香族溶剂(如烷基苯或烷基萘)以及在水中具有低溶解度的其他适当的有机溶剂。

[0444] 微乳液(ME)可以通过将水与一种或多种溶剂和一种或多种SFA的共混物混合进行制备,以自发地产生热力学稳定的各向同性的液体配制品。具有式(I)的化合物最初存在于水中或溶剂/SFA共混物中。在ME中使用的合适的溶剂包括此前描述的在EC或EW中使用的那些。ME可以是水包油体系或油包水体系(存在哪种体系可以通过传导率测试来测定)并且可以适用于在同一配制品中混合水溶性的和油溶性的杀有害生物剂。ME适用于稀释到水中,保持为微乳液或形成常规的水包油乳液。

[0445] 悬浮浓缩物(SC)可以包括具有式(I)的化合物的精细分散的不溶固体颗粒的水性或非水性悬浮液。SC可以通过将具有式(I)的固体化合物任选地与一种或多种分散剂在合适的介质中球磨或珠磨来制备,以产生所述化合物的细颗粒悬浮液。在所述组合物中可以包含一种或多种湿润剂,并且可以包含悬浮剂以降低颗粒的沉降速率。可替代地,可以干磨具有式(I)的化合物并且将其添加到含有此前描述的试剂的水中,以产生希望的终产物。

[0446] 气溶胶配制品包含具有式(I)的化合物和合适的推进剂(例如,正丁烷)。还可将具有式(I)的化合物溶于或分散于合适的介质(例如水或可与水混溶的液体,如正丙醇)中以提供在不加压的手动喷雾泵中使用的组合物。

[0447] 胶囊悬浮液(CS)可以通过与制备EW配制品类似的方式来制备,但具有另外的聚合阶段,这样使得获得油滴的水性分散体,其中每个油滴都被聚合物壳所包裹并且含有具有式(I)的化合物以及任选地其载体或稀释剂。所述聚合物壳可以通过界面缩聚反应或通过凝聚程序产生。这些组合物可以提供具有式(I)的化合物的受控释放并且它们可以用于种子处理。具有式(I)的化合物还可以配制在生物可降解的聚合物基质中以提供所述化合物的缓慢的、受控的释放。

[0448] 组合物可以包含一或多种添加剂以改进所述组合物的生物学性能,例如通过改进在表面上的湿润性,保持力或分布;被处理表面上的耐雨水性;或具有式(I)的化合物的吸收或流动。这样的添加剂包括表面活性剂(SFA)、基于油的喷雾添加剂,例如某些矿物油或天然植物油(如大豆和油菜籽油),以及这些与其他生物增强辅助剂(可帮助或改变具有式(I)的化合物的作用的成分)的共混物。

[0449] 湿润剂、分散剂和乳化剂可以是阳离子类型、阴离子类型、两性类型或非离子类型的SFA。

[0450] 合适的阳离子类型的SFA包括季铵化合物(例如十六烷基三甲基溴化铵)、咪唑啉以及胺盐。

[0451] 适合的阴离子型SFA包括脂肪酸的碱金属盐、脂肪族硫酸单酯的盐(例如月桂硫酸钠)、磺化的芳香族化合物的盐(例如十二烷基苯磺酸钠、十二烷基苯磺酸钙、丁基萘磺酸盐以及二-异丙基-萘磺酸钠和三-异丙基-萘磺酸钠的混合物)、醚硫酸盐、醇醚硫酸盐(例如月桂醇聚醚-3-硫酸钠)、醚羧酸盐(例如月桂醇聚醚-3-羧酸钠)、磷酸酯(来自一种或多种脂肪醇与磷酸(主要是单酯)或与五氧化二磷(主要是二酯)之间反应的产物,例如月桂醇与四磷酸之间的反应;另外这些产物可以被乙氧基化)、硫代琥珀酰胺酸盐、石蜡或烯烃磺酸盐、牛磺酸盐以及木质磺酸盐。

[0452] 合适的两性型的SFA包括甜菜碱、丙酸盐和甘氨酸盐。

[0453] 合适的非离子类型的SFA包括环氧烷(如环氧乙烷、环氧丙烷、环氧丁烷或其混合物)与脂肪醇(如油醇或鲸蜡醇)或与烷基酚(如辛基酚、壬基酚或辛基甲酚)的缩合产物;衍生自长链脂肪酸或己糖醇酐的偏酯;所述偏酯与环氧乙烷的缩合产物;嵌段聚合物(含有环氧乙烷和环氧丙烷);链烷醇酰胺;单酯(例如脂肪酸聚乙二醇酯);胺氧化物(如月桂基二甲基氧化胺);和卵磷脂。

[0454] 合适的悬浮剂包括亲水性胶体(如多糖、聚乙烯吡咯烷酮或羧甲基纤维素钠)和膨胀性粘土(如膨润土或凹凸棒石)。

[0455] 本发明的组合物可以进一步包含至少一种另外的杀有害生物剂。例如,根据本发明的化合物也可以与其他除草剂或植物生长调节剂组合使用。在优选的实施例中,所述另外的杀有害生物剂是除草剂和/或除草剂安全剂。此类混合物的具体实例包括(其中“I”表示具有式(I)的化合物):I+乙草胺;I+三氟羧草醚(包括三氟羧草醚-钠);I+苯草醚;I+莠灭净;I+氨唑草酮;I+氯氨基吡啶酸;I+杀草强;I+莠去津;I+be flubutamid-M;I+benquitrione;I+苄嘧磺隆(包括苄嘧磺隆-甲基);I+噻草平;I+二环吡喃酮;I+双丙氨膦;I+双草醚-钠;I+bixlozone;I+除草定;I+溴苯腈;I+丁草胺;I+氟丙嘧草酯;I+唑啶草酯(包括唑啶草酯-乙基);I+氯酯磺草胺(包括氯酯磺草胺-甲基);I+氯嘧磺隆(包括氯嘧磺隆-乙基);I+绿麦隆;I+氯磺隆;I+环庚草醚;I+氯酰草膦(clacyfos);I+烯草酮;I+炔草酸(包括炔草酸-炔丙基);I+异噁草酮;I+二氯吡啶酸;I+环吡拉尼(cyclopyranil);I+环吡瑞莫(cyclopyrimorate);I+环丙嘧磺隆;I+氰氟草酯(包括氰氟草酯-丁基);I+2,4-D(包括其胆碱盐和2-乙基己酯);I+2,4-DB;I+甜菜安;I+麦草畏(包括其铝、氨基丙基;双-氨基丙基甲基;胆碱;二氯丙;二甘醇胺;二甲胺;二甲基铵;钾和钠盐);I+双氯磺草胺;I+吡氟草胺;I+氟吡草胺;I+二甲草胺;I+精二甲吩草胺;I+敌草快二溴化物;I+敌草隆;I+epyrifenacil;I+丁氟消草;I+乙氧呋草黄;I+噁唑禾草灵(包括精噁唑禾草灵-乙基);I+异噁苯砜(fenoxasulfone);I+芬诺杀磺隆;I+fenquino-trione;I+四唑啉草胺;I+啶嘧磺隆;I+双氟磺草胺;I+氯氟吡啶酯(包括氯氟吡啶酯-苄基);I+吡氟禾草灵(包括精吡氟禾草灵-丁基);I+氟酮磺隆(包括氟酮磺隆-钠);I+氟噻草胺;I+唑嘧磺草胺;I+丙炔氟草胺;I+氟草隆;I+氟啶嘧磺隆(包括氟啶嘧磺隆-甲基-钠);I+氟草烟(包括氯氟吡氧乙酸(fluroxypyr-meptyl));I+氟磺胺草醚;I+甲酰胺磺隆;I+草铵膦(包括其铵盐);I+草甘膦(包括其联胺;异丙基铵和钾盐);I+氟氯吡啶酯(haloxifen)(包括氟氯吡啶酯-甲基);I+吡氟氯禾灵(包括吡氟氯禾灵-甲基);I+环嗪酮;I+hydantocidin;I+甲氧咪草烟;I+甲基咪草烟;I+灭草烟;I+咪草烟;I+三嗪茛草胺(indaziflam);I+碘甲磺隆(包括碘甲磺隆-甲基-钠);I+iofensulfuron(包括I+iofensulfuron-钠);I+碘苯腈;I+异丙隆;I+异噁唑草酮;I+

lancotrione; I+MCPA; I+MCPB; I+高二甲四氯丙酸 (mecoprop-P); I+甲基二磺隆 (包括 I+甲基二磺隆-甲基); I+甲基磺草酮; I+苯嗪草酮; I+吡草胺; I+异噁唑草醚 (methiozolin); I+异丙甲草胺; I+磺草唑胺; I+嗪草酮; I+甲磺隆; I+敌草胺; I+烟嘧磺隆; I+达草灭; I+噁草酮; I+环氧嘧磺隆; I+乙氧氟草醚; I+二氯化百草枯; I+二甲戊乐灵; I+五氟磺草胺; I+苯敌草; I+毒莠定; I+唑啉草酯; I+丙草胺; I+氟嘧磺隆-甲基; I+扑草净; I+敌稗; I+喔草酯; I+丙嗪磺隆 (propyrisulfuron), I+戊炔草胺; I+苜草丹; I+氟磺隆; I+双唑草腈; I+吡草醚 (包括吡草醚-乙基); I+磺酰草吡唑; I+哒草特; I+环酯草醚; I+pyrimisulfan, I+吡咯磺隆 (pyroxasulfone); I+啶磺草胺; I+二氯喹啉酸; I+氯甲喹啉酸; I+喹禾灵 (包括精喹禾灵-乙基和喹禾糠酯 (quizalofop-P-tefuryl)); I+砒嘧磺隆; I+嘧啶肟草醚; I+烯禾啶; I+西玛津; I+S-异丙甲草胺; I+甲磺草胺; I+磺酰磺隆; I+特丁噻草隆; I+特呋三酮; I+环磺酮; I+特丁津; I+特丁净; I+tetflupyrolimet; I+噻酮磺隆 (thiencarbazone); I+噻吩磺隆; I+地芬纳噻 (tiafenacil); I+托比利特 (tolpyralate); I+苯吡唑草酮; I+三甲苯草酮; I+氟酮磺草胺 (triafamone); I+野麦畏; I+醚苯磺隆; I+苯磺隆 (包括苯磺隆-甲基); I+绿草定; I+三氟啶磺隆 (包括三氟啶磺隆-钠); I+三气草啉 (trifludimoxazin); I+氟乐灵; I+氟胺磺隆; I+3-(2-氯-4-氟-5-(3-甲基-2,6-二氧化-4-三氟甲基-3,6-二氢嘧啶-1(2H)-基)苯基)-5-甲基-4,5-二氢异噁唑-5-甲酸乙酯; I+4-羟基-1-甲氧基-5-甲基-3-[4-(三氟甲基)-2-吡啶基]咪唑烷-2-酮; I+4-羟基-1,5-二甲基-3-[4-(三氟甲基)-2-吡啶基]咪唑烷-2-酮; I+5-乙氧基-4-羟基-1-甲基-3-[4-(三氟甲基)-2-吡啶基]咪唑烷-2-酮; I+4-羟基-1-甲基-3-[4-(三氟甲基)-2-吡啶基]咪唑烷-2-酮; I+4-羟基-1,5-二甲基-3-[1-甲基-5-(三氟甲基)吡啶-3-基]咪唑烷-2-酮; I+(4R)1-(5-叔丁基异噁唑-3-基)-4-乙氧基-5-羟基-3-甲基-咪唑烷-2-酮; I+3-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]双环[3.2.1]辛烷-2,4-二酮; I+2-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-5-甲基-环己烷-1,3-二酮; I+2-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]环己烷-1,3-二酮; I+2-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-5,5-二甲基-环己烷-1,3-二酮; I+6-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-2,2,4,4-四甲基-环己烷-1,3,5-三酮; I+2-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-5-乙基-环己烷-1,3-二酮; I+2-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-4,4,6,6-四甲基-环己烷-1,3-二酮; I+2-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-5-甲基-环己烷-1,3-二酮; I+3-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]双环[3.2.1]辛烷-2,4-二酮; I+2-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-5,5-二甲基-环己烷-1,3-二酮; I+6-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-2,2,4,4-四甲基-环己烷-1,3,5-三酮; I+2-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]环己烷-1,3-二酮; I+4-[2-(3,4-二甲氧基苯基)-6-甲基-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-2,2,6,6-四甲基-四氢吡喃-3,5-二酮; I+4-[6-环丙基-2-(3,4-二甲氧基苯基)-3-氧代-哒嗪-4-羰基]-2,2,6,6-四甲基-四氢吡喃-3,5-二酮; I+4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吡啶-6-基)吡啶-2-甲酸 (包括其农用化学上可接受的酯,例如,4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吡啶-6-基)吡啶-2-甲酸甲酯、4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吡啶-6-基)吡啶-2-甲酸丙-2-炔酯和4-氨基-3-氯-5-氟-6-(7-氟-1H-吡啶-6-基)吡啶-2-甲酸氨基甲酯); I+3-乙基硫烷基-N-(1,3,4-噁二唑-2-基)-5-(三氟甲基)-[1,2,4]三唑并

[4,3-a]吡啶-8-甲酰胺;I+3-(异丙基硫烷基甲基)-N-(5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基)-5-(三氟甲基)-[1,2,4]三唑并[4,3-a]吡啶-8-甲酰胺;I+3-(异丙基磺酰基甲基)-N-(5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基)-5-(三氟甲基)-[1,2,4]三唑并[4,3-a]吡啶-8-甲酰胺;I+3-(乙基磺酰基甲基)-N-(5-甲基-1,3,4-噁二唑-2-基)-5-(三氟甲基)-[1,2,4]三唑并[4,3-a]吡啶-8-甲酰胺;I+2-[[3-[[3-氯-5-氟-6-[3-甲基-2,6-二氧化-4-(三氟甲基)嘧啶-1-基]-2-吡啶基]氧基]乙酸乙酯;I+6-氯-4-(2,7-二甲基-1-萘基)-5-羟基-2-甲基-哒嗪-3-酮;I+1-[2-氯-6-(5-氯嘧啶-2-基)氧基-苯基]-4,4,4-三氟-丁-1-酮以及I+5-[2-氯-6-(5-氯嘧啶-2-基)氧基-苯基]-3-(二氟甲基)异噁唑。

[0456] 具有式(I)的化合物的混合配伍物还可以呈酯或盐的形式,例如像在The Pesticide Manual[杀有害生物剂手册],第十四版,British Crop Protection Council[英国作物保护委员会],2006中所提到的。

[0457] 具有式(I)的化合物还可以在与其它农用化学品(如杀真菌剂、杀线虫剂或杀昆虫剂)的混合物中使用,这些农用化学品的实例在杀有害生物剂手册中给出。

[0458] 具有式(I)的化合物与混合配伍物的混合比优选地是从1:100至1000:1。

[0459] 这些混合物可以有利地用于以上提到的配制品中(在这种情况下“活性成分”涉及具有式(I)的化合物与混合配伍物的对应混合物)。

[0460] 本发明的具有式(I)的化合物也可以与除草剂安全剂组合。优选的组合(其中“I”表示具有式(I)的化合物)包括:

[0461] I+解草啉、I+解草酯(包括解草啉(cloquintocet-mexyl))、I+环丙磺酰胺、I+二氯丙烯胺、I+解草啉(包括解草啉-乙基)、I+解草啉、I+氟草肟、I+解草啉、I+双苯噁唑酸(包括双苯噁唑酸-乙基)、I+吡啶解草酸(包括吡啶解草酸-二乙基)、I+metcamifen和I+解草腈。

[0462] 特别优选的是具有式(I)的化合物与环丙磺酰胺、双苯噁唑酸(包括双苯噁唑酸-乙基)、解草酯(包括解草啉)和/或N-(2-甲氧基苯甲酰基)-4-[(甲基-氨基羰基)氨基]苯磺酰胺的混合物。

[0463] 具有式(I)的化合物的安全剂还可以处于酯或盐的形式,例如像在杀有害生物剂手册,第14版(BCPC),2006中所提到的。对解草啉的提及还适用于锂、钠、钾、钙、镁、铝、铁、铵、季铵、铈或其磷盐(如在W0 02/34048中披露的),并且对解草啉乙酯的提及还适用于解草啉等。

[0464] 优选地,具有式(I)的化合物与安全剂的混合比是从100:1至1:10,尤其是从20:1至1:1。

[0465] 具有式(I)的化合物还可以在与其它农用化学品(如杀真菌剂、杀线虫剂或杀昆虫剂)的混合物中使用,这些农用化学品的实例在杀有害生物剂手册中给出。

[0466] 具有式(I)的化合物与混合配伍物的混合比优选地是从1:100至1000:1。

[0467] 这些混合物可以有利地用于以上提到的这些配制品中(在这种情况下“活性成分”涉及具有式I的化合物与混合配伍物的对应混合物)。

[0468] 本发明还进一步提供了一种在包括作物植物和杂草的场所选择性地控制杂草的方法,其中所述方法包括向所述场所施用控制杂草量的根据本发明的组合物。‘控制’意指杀死、减少或延迟生长或防止或减少发芽。通常有待控制的植物是不想要的植物(杂草)。

‘场所’意指植物正生长或将生长的区域。

[0469] 具有式(I)的化合物的施用率可以在宽范围之内变化并且取决于土壤的性质、施用方法(出苗前或出苗后;拌种;施用至种子垄沟;免耕施用等)、作物植物、一种或多种有待控制的杂草、主要气候条件、以及受施用方法、施用时间以及目标作物支配的其他因素。根据本发明的具有式I的化合物通常以从10g/ha至2000g/ha,尤其是从50g/ha到1000g/ha的比率施用。

[0470] 通常通过喷洒所述组合物进行施用,典型地是通过用于大面积的装在拖拉机上的喷洒机,但是还可以使用其他方法如撒粉(针对粉末)、滴加或浸湿。

[0471] 可以使用根据本发明的组合物的有用植物包括作物如谷物,例如大麦和小麦、棉花、油菜籽油菜、向日葵、玉米、稻、大豆、甜菜、甘蔗以及草皮。

[0472] 作物植物还可以包括树,如果树、棕榈树、椰子树或其他坚果。还包括藤本植物(如葡萄)、灌木果树、果实植物和蔬菜。

[0473] 作物应被理解为还包括通过常规的育种方法或通过基因工程已经赋予对除草剂或多种类别的除草剂(例如ALS-抑制剂、GS-抑制剂、EPSPS-抑制剂、PPO-抑制剂、ACC酶-抑制剂以及HPPD-抑制剂)的耐受性的那些作物。通过常规育种方法已经赋予其对咪唑啉酮(例如,甲氧咪草烟)的耐受性的作物的实例是**Clearfield®**夏季油菜(卡诺拉(canola))。通过基因工程方法而赋予对除草剂的耐受性的作物的实例包括例如草甘膦和草丁膦抗性的玉米品种,所述玉米品种在**RoundupReady®**和**LibertyLink®**商标名下是可商购的。在特别优选方面,所述作物植物已经如在例如WO 2010/029311中所传授的被工程化,以过表达尿黑酸茄呢基转移酶。

[0474] 作物还应被理解为通过基因工程方法已经赋予其对有害昆虫的抗性的那些作物,例如Bt玉米(对欧洲玉米螟有抗性)、Bt棉花(对棉铃象鼻虫有抗性)以及还有Bt马铃薯(对科罗拉多甲虫有抗性)。Bt玉米的实例是**NK®**的Bt 176玉米杂交体(先正达种子公司(Syngenta Seeds))。Bt毒素是由苏芸金芽孢杆菌土壤细菌天然形成的蛋白质。毒素或能够合成此类毒素的转基因植物的实例被描述在EP-A-451 878、EP-A-374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、WO 03/052073和EP-A-427 529中。包含一个或多个编码杀昆虫剂抗性和表达一种或多种毒素的基因的转基因植物的实例是**KnockOut®**(玉米)、**Yield Gard®**(玉米)、**NuCOTIN33B®**(棉花)、**Bollgard®**(棉花)、**NewLeaf®**(马铃薯)、**NatureGard®**以及**Protexcta®**。植物作物或其种子材料均可以是抗除草剂的并且同时是抗昆虫摄食的(“叠加的”转基因结果)。例如,种子可以在具有表达杀昆虫的Cry3蛋白的能力的同时是耐草甘膦的。

[0475] 作物还应被理解为包括通过常规育种方法或基因工程获得并且含有所谓输出性状(例如改进的储存稳定性、更高的营养价值以及改进的香味)的那些作物。

[0476] 其他有用的植物包括例如在高尔夫球场、草地、公园以及路旁的或者商业上种植用于草地的草皮草,以及观赏植物,如花卉或灌木。

[0477] 可以使用这些组合物来控制不想要的植物(统称为‘杂草’)。有待控制的杂草包括单子叶的物种,例如剪股颖属、看麦娘属、燕麦属、臂形草属、雀麦属、蒺藜草属、莎草属、马唐属、稗属、稊属、黑麦草属、雨久花属、筒轴茅属、慈姑属、藨草属、狗尾草属以及高粱属;和

双子叶的物种,例如苘麻属、苋属、豚草属、藜属、菊属、白酒草属、拉拉藤属、番薯属、早金莲属、黄花稔属、白芥属、茄属、繁缕属、婆婆纳属、莧菜属以及苍耳属。杂草还可以包括可被认为是作物植物但是在作物区外生长的植物(‘逃逸者(escapes)’),或从先前栽培的不同作物留下的种子生长的植物(‘志愿者(volunteers)’)。此类志愿者或逃逸者可以是对某些其他除草剂耐受的。

[0478] 现在通过举例更详细地说明本发明的不同方面和实施例。应当理解的是,在不偏离本发明范围的情况下,可以对细节做出修改。

[0479] 本文使用的典型的缩写包括:

[0480] br=宽Db

[0481] <sup>t</sup>Bu=叔丁基

[0482] d=二重峰

[0483] dba=二亚苈基丙酮

[0484] DCM=二氯甲烷

[0485] DMSO=二甲亚砜

[0486] DPPA=叠氮化磷酸二苯酯

[0487] Et<sub>2</sub>O=二乙醚

[0488] EtOAc=乙酸乙酯

[0489] h=小时

[0490] m=多重峰

[0491] Me=甲基

[0492] MeOH=甲醇

[0493] Ph=苯基

[0494] <sup>i</sup>Pr=异丙基

[0495] rt=室温

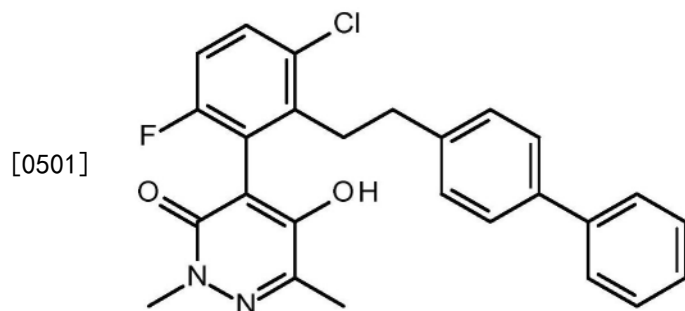
[0496] s=单峰

[0497] t=三重峰

[0498] THF=四氢呋喃

[0499] 制备实例

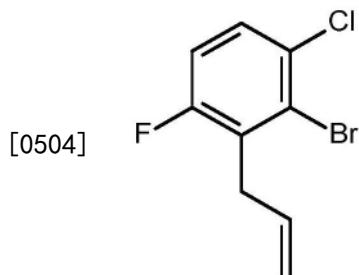
[0500] 实例1 4-[3-氯-6-氟-2-[2-(4-苯基苯基)乙基]苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-吡嗪-3-酮(A-1.027)的制备



[0502] 1.1 3-烯丙基-2-溴-1-氯-4-氟-苯

[0503] 将二异丙基氨基锂的溶液(在四氢呋喃中2M,3.6ml,7.2mmol)在氮气下冷却至-78

°C。在-78°C下,逐滴地添加2-溴-1-氯-4-氟-苯(1.0g,4.8mmol)在四氢呋喃中的溶液。将混合物在用烯丙基溴(0.3ml,5.7mmol)处理之前在同一温度下搅拌45分钟。将反应在-78°C下继续进行2h然后升温至室温。将反应用饱和NH<sub>4</sub>Cl(水性)淬灭并且用乙酸乙酯萃取。将有机物分离并保留,然后将其用盐水洗涤。将有机物经硫酸钠干燥并在减压下浓缩,以给出呈油状物的3-烯丙基-2-溴-1-氯-4-氟-苯(1.2g,100%)。



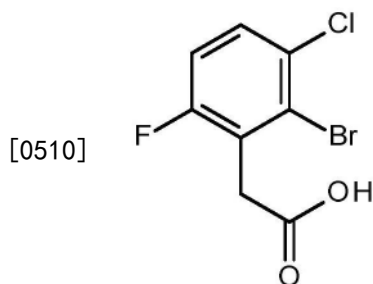
[0505] <sup>1</sup>H NMR (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ<sub>H</sub>: 7.34-7.30 (m, 1H), 7.01-6.96 (m, 1H), 5.94-5.83 (m, 1H), 5.10-5.00 (m, 2H), 3.64-3.58 (m, 2H)。

[0506] 1.2 2-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)乙酸

[0507] 将3-烯丙基-2-溴-1-氯-4-氟-苯(15.0g,60.1mmol)于二氯甲烷(200mL)中的溶液在2颈烧瓶中冷却至-78°C。将一侧颈连接到包含KI的水溶液的阱上。将臭氧鼓泡通过所述溶液,直至起始材料被完全消耗(5小时)。将空气鼓泡通过所述溶液持续10分钟,以除去过量的臭氧。添加二甲基硫醚(44ml,601mmol),并将混合物升温至室温。将所述反应在室温下继续16h。

[0508] 将混合物用盐水(2×100mL)洗涤,并保留有机层。将有机物经Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>干燥、过滤并在减压下浓缩,以给出粗的2-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)乙醛(15.3g),将其不经进一步纯化用于下一步骤。

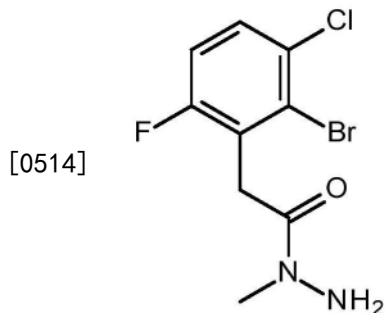
[0509] 将粗的2-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)乙醛(15.3g,60.8mmol)溶于叔丁醇(92mL)和水(46mL)的混合物中,然后冷却至0°C。添加2-甲基丁-2-烯(64.5mL,608mmol)、磷酸二氢钠(34.6g,243mmol)和亚氯酸钠(16.5g,163mmol)。将混合物搅拌2h,然后用盐水(150mL)和2M盐酸(150mL)稀释。将混合物用乙酸乙酯(3×100mL)萃取。将合并的有机萃取物用饱和焦亚硫酸钠水溶液(100mL)洗涤,然后经Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>干燥、过滤并在减压下浓缩以提供淡黄色固体。将粗固体溶解水(100mL)和2.0M NaOH(30mL)的混合物中。将水溶液用乙酸乙酯(100mL)洗涤并丢弃有机物。通过添加浓盐酸(20mL)将水层酸化,导致形成白色悬浮液。将混合物用乙酸乙酯(3×200mL)萃取。将合并的有机物用盐水洗涤、经Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>干燥、过滤并蒸发,以提供呈白色固体的2-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)乙酸(8.0g,49%)。



[0511] <sup>1</sup>H NMR (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ<sub>H</sub>: 12.79 (br. s, 1H), 7.67-7.59 (m, 1H), 7.39-7.31 (m, 1H), 3.82 (s, 2H)。

[0512] 1.3 2-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)-N-甲基-乙酰肼

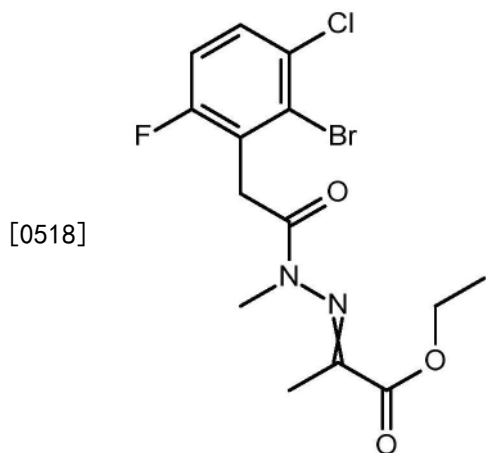
[0513] 向0°C下的2-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)乙酸(2.0g,7.5mmol)在二氯甲烷(20ml)中的搅拌溶液中添加N-(3-二甲基氨基丙基)-N'-乙基碳二亚胺盐酸盐[EDC.HCl](1.4g,9.0mmol),接着逐滴地添加甲基肼(0.4ml,7.5mmol)。将反应混合物的温度维持在0°C持续3h。然后将反应用水淬灭并萃取至二氯甲烷中。将有机物分离、用盐水洗涤并经Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>干燥。在减压下浓缩给出粗的2-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)-N-甲基-乙酰肼(1.8g,81%),将其不经进一步纯化用于下一步骤。



[0515] <sup>1</sup>H NMR (400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ<sub>H</sub>: 7.59 (dd, J=8.9和5.4, 1H), 7.30 (t, J=8.9, 1H), 4.91 (s, 2H), 4.10 (br. s, 2H), 3.02 (s, 3H)。

[0516] 1.4 2- {[2-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)-乙酰基]-甲基-亚肼基}-丙酸乙基酯

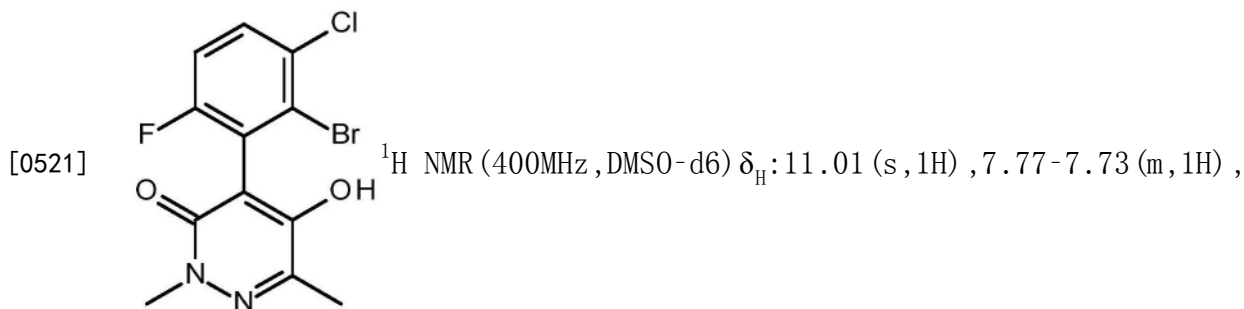
[0517] 向2-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)-N-甲基-乙酰肼(1.8g,6.09mmol)在乙醇(5ml)中的搅拌溶液中逐滴地添加丙酮酸乙酯(0.7ml,6.7mmol)。将反应在80°C下加热4h。然后将反应混合物冷却至室温,并在减压下蒸发。将残余物通过硅胶柱色谱法(洗脱液,乙酸乙酯/己烷梯度)纯化,以给出呈灰白色固体的所希望的化合物2- {[2-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)-乙酰基]-甲基-亚肼基}-丙酸乙基酯(1.8g,75%)。



[0519] <sup>1</sup>H NMR (400MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ<sub>H</sub>: 7.40-7.35 (m, 1H), 7.04-6.98 (m, 1H), 4.32 (q, J=7.1, 2H), 4.24 (s, 2H), 3.41 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 1.36 (t, J=7.1, 3H)。

[0520] 1.5 4-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)-5-羟基-2,6-二甲基-吡嗪-3-酮将2- {[2-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)-乙酰基]-甲基-亚肼基}-丙酸乙基酯(500mg,1.27mmol)溶解于乙腈(2.5ml)中并用1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯[DBU](0.47ml,3.2mmol)处理。使用微波辐射将混合物加热至125°C持续1h。然后将反应混合物在减压下蒸发。将残余物溶解于水中并用2N盐酸酸化至pH 1。将混合物用DCM萃取,将有机物分离并用盐水溶液洗涤。将有机

溶液经 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ 干燥并在减压下浓缩以给出粗产物。将所述粗产物通过硅胶柱色谱法(洗脱液,乙酸乙酯/己烷梯度)纯化以给出呈灰白色固体的4-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)-5-羟基-2,6-二甲基-吡嗪-3-酮(340mg,77.1%)。

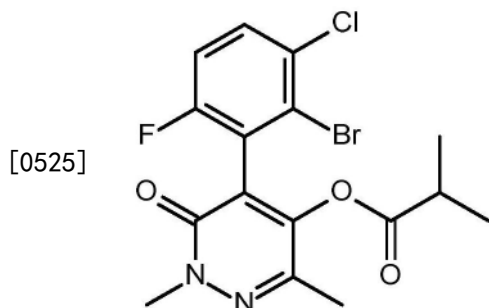


7.39 (t,  $J=8.7$ , 1H), 3.58 (s, 3H), 2.24 (s, 3H)。

[0522] 1.6 2-甲基丙酸[5-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)-1,3-二甲基-6-氧代-吡嗪-4-基]酯

[0523] 向室温下的4-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)-5-羟基-2,6-二甲基-吡嗪-3-酮(1.4g, 4.02mmol)在二氯甲烷(32ml)中的搅拌溶液中添加三乙胺(1.1ml, 8.06mmol)、4-(二甲基氨基)吡啶[DMAP](49mg, 0.40mmol)和异丁酰氯(0.6ml, 4.83mmol)。

[0524] 一旦判断完成,将反应用二氯甲烷和水稀释。将有机层分离、经 $\text{Na}_2\text{SO}_4$ 干燥并在减压下浓缩以给出粗产物。将所述粗产物通过硅胶柱色谱法(洗脱液,乙酸乙酯/己烷梯度)纯化以给出2-甲基丙酸[5-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)-1,3-二甲基-6-氧代-吡嗪-4-基]酯(1.47g,87%)。

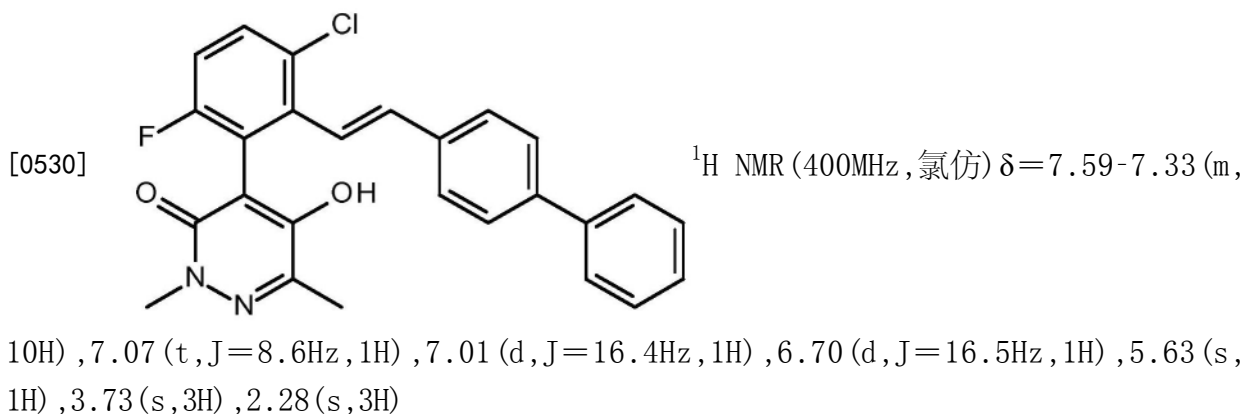


[0526]  $^1\text{H NMR}$  (400MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta_{\text{H}}$ : 7.51-7.47 (m, 1H), 7.10-7.05 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 2.60-2.55 (m, 1H), 2.25 (s, 3H), 1.02-0.98 (m, 6H)。

[0527] 1.7 4-[3-氯-6-氟-2-[(E)-2-(4-苯基苯基)乙烯基]苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-吡嗪-3-酮(A-2.027)

[0528] 将2-甲基丙酸[5-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)-1,3-二甲基-6-氧代-吡嗪-4-基]酯(0.54g, 1.3mmol)、 $\text{K}_2\text{CO}_3$ (0.55g, 3.9mmol)、反式-2-(4-苯基苯基)乙烯基硼酸(0.44g, 2.00mmol)、 $\text{PdCl}_2(\text{dppf})\cdot\text{DCM}$ (53mg, 0.065mmol)、1,4-二噁烷(13ml)和 $\text{H}_2\text{O}$ (3.3mL)在20mL微波小瓶中合并,然后在 $140^\circ\text{C}$ 下在微波辐射下加热30min。

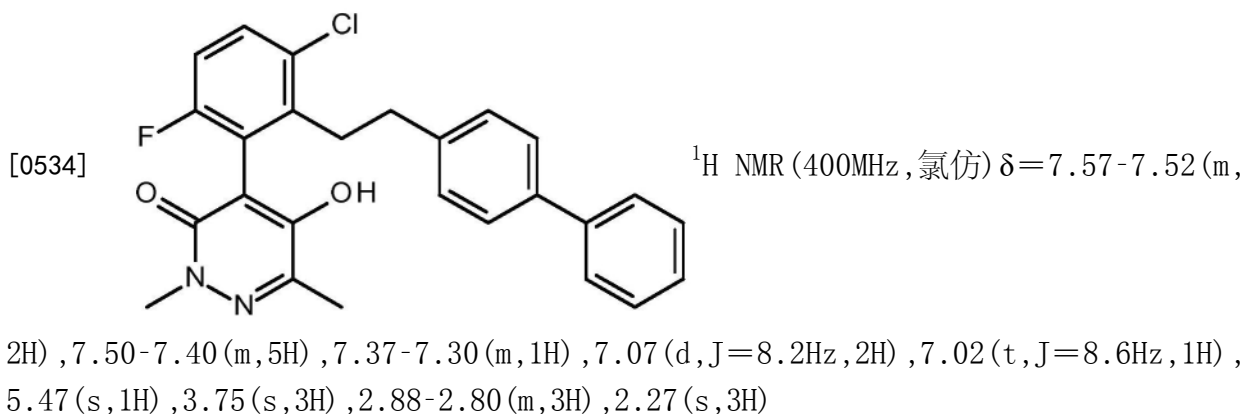
[0529] 将反应混合物在真空中浓缩以除去1,4-二噁烷,然后在2N HCl(水性)与DCM之间分配。分离有机层并且用另外部分的DCM(x2)萃取水层。将合并的有机物在真空中浓缩以给出粗残余物,将其通过硅胶柱色谱法(洗脱液,乙酸乙酯/己烷梯度)纯化以给出呈黄色泡沫的4-[3-氯-6-氟-2-[(E)-2-(4-苯基苯基)乙烯基]苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-吡嗪-3-酮(343mg,53%,A-2.027)。



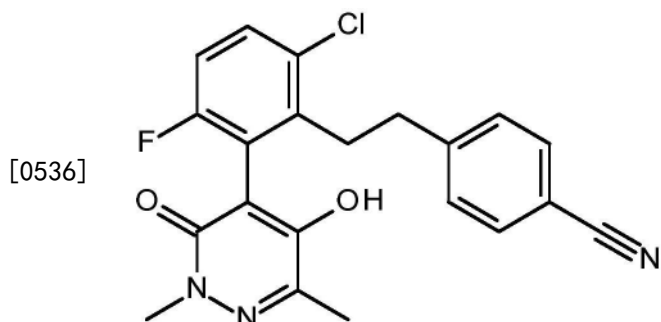
[0531] 1.8 4-(3-氯-6-氟-2-苯乙基-苯基)-5-羟基-2,6-二甲基-咪嗪-3-酮 (A-1.027)

[0532] 向10mL圆底烧瓶中添加5% Pd/C (73mg, 0.034mmol), 接着添加4-[3-氯-6-氟-2-(E)-2-(4-苯基苯基)乙烯基]苯基-5-羟基-2,6-二甲基-咪嗪-3-酮 (308mg, 0.69mmol) 在10:1 (v/v) DCM/MeOH (4mL) 中的溶液。然后添加  $\text{B}_2(\text{OH})_4$  (325mg, 3.45mmol), 并且将反应混合物在室温下搅拌过夜。

[0533] 然后将反应混合物通过 **Celite®** 过滤, 用10:1 (v/v) DCM/MeOH 洗脱。将滤液干燥负载到二氧化硅上并通过硅胶柱色谱法 (洗脱液, 乙酸乙酯/己烷梯度) 纯化以给出呈黄色油状物的4-[3-氯-6-氟-2-[2-(4-苯基苯基)乙基]苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-咪嗪-3-酮 (299mg, 97% 产率, A-1.027), 其在静置时凝固。



[0535] 实例2 4-[2-[6-氯-3-氟-2-(5-羟基-2,6-二甲基-3-氧代-咪嗪-4-基)苯基]乙基]苯甲腈 (A-1.036) 的制备

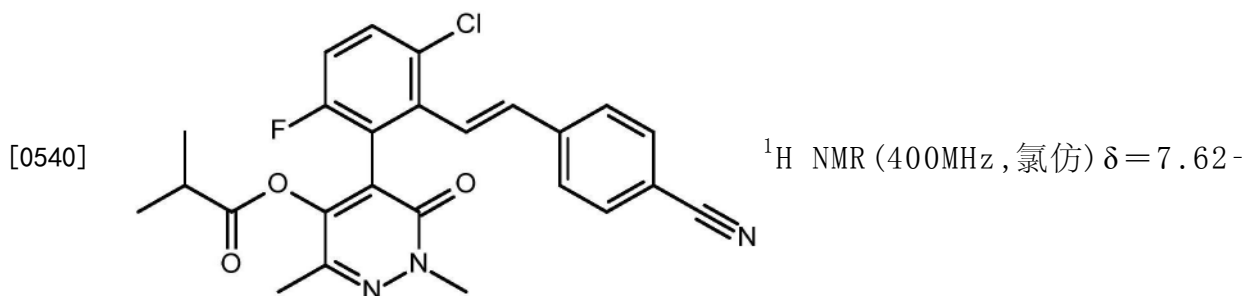


[0537] 2.1 2-甲基丙酸[5-[3-氯-2-(E)-2-(4-氰基苯基)乙烯基]-6-氟-苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-咪嗪-4-基]酯 (4.036)

[0538] 将2-甲基丙酸[5-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)-1,3-二甲基-6-氧代-咪嗪-4-基]酯

(1.10g, 2.63mmol) [如实例1中所述的制备]和氯[(三叔丁基膦)-2-(2-氨基联苯基)]钯(II) (68mg, 0.13mmol) 在脱气甲苯(12mL)中合并。然后添加4-乙炔基苯甲腈(408mg, 3.16mmol)和胡宁氏碱(Hunig's base) (0.92mL, 5.27mmol), 并且将反应混合物加热至95°C持续2.5h。

[0539] 将反应混合物冷却至室温, 然后将其用二氯甲烷稀释并通过硅藻土过滤, 用另外的二氯甲烷洗涤。将滤液在真空中浓缩, 然后通过硅胶柱色谱法(洗脱液, 乙酸乙酯/己烷梯度)纯化以给出呈白色固体的2-甲基丙酸[5-[3-氯-2-[(E)-2-(4-氰基苯基)乙烯基]-6-氟-苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-哒嗪-4-基]酯(781mg, 64%产率, A-4.036)



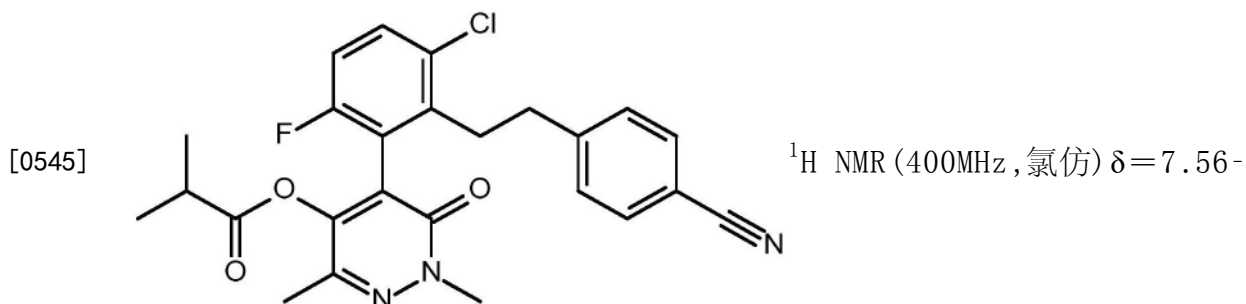
7.55(m, 2H), 7.45(dd,  $J = 5.0, 8.5\text{Hz}$ , 1H), 7.45-7.40(m, 1H), 7.13(d,  $J = 16.5\text{Hz}$ , 1H), 7.05(t,  $J = 8.5\text{Hz}$ , 1H), 6.68(d,  $J = 16.5\text{Hz}$ , 1H), 3.69(s, 3H), 2.65(spt,  $J = 7.0\text{Hz}$ , 1H), 2.23(s, 3H), 1.11(d,  $J = 7.0\text{Hz}$ , 3H), 1.07(d,  $J = 7.0\text{Hz}$ , 3H)。

[0541] 2.2 2-甲基丙酸[5-[3-氯-2-[2-(4-氰基苯基)乙基]-6-氟-苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-哒嗪-4-基]酯(A-3.036)

[0542] 使2-甲基丙酸[5-[3-氯-2-[(E)-2-(4-氰基苯基)乙烯基]-6-氟-苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-哒嗪-4-基]酯(900mg, 1.93mmol)在4巴 $\text{H}_2$ 下在EtOAc(20mL)中在5%Pd/C(50%湿)催化剂(0.82g)上经受催化氢化。

[0543] 1.5h后, LC/MS示出完全反应。将反应混合物通过 **Celite®** 垫过滤, 用乙酸乙酯洗涤。将滤液在真空中浓缩以得到粗残余物。

[0544] 将残余物吸附到二氧化硅上并通过硅胶柱色谱法(洗脱液, 乙酸乙酯/己烷梯度)纯化以给出呈白色固体的2-甲基丙酸[5-[3-氯-2-[2-(4-氰基苯基)乙基]-6-氟-苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-哒嗪-4-基]酯(800mg, 81%产率, A-3.036)。



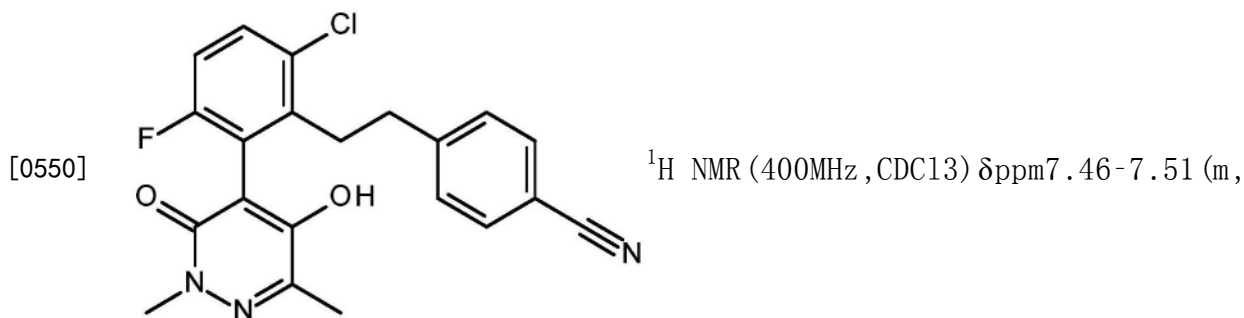
7.51(m, 2H), 7.42(dd,  $J = 5.2, 8.9\text{Hz}$ , 1H), 7.26-7.21(m, 2H), 7.00(t,  $J = 8.9\text{Hz}$ , 1H), 3.84(s, 3H), 3.02-2.92(m, 1H), 2.91-2.80(m, 2H), 2.75-2.65(m, 1H), 2.54(spt,  $J = 7.0\text{Hz}$ , 1H), 2.25(s, 3H), 0.98(d,  $J = 7.0\text{Hz}$ , 3H), 0.95(d,  $J = 7.0\text{Hz}$ , 3H)。

[0546] 2.3 4-[2-[6-氯-3-氟-2-(5-羟基-2,6-二甲基-3-氧代-哒嗪-4-基)苯基]乙基]苯甲腈(A-1.036)

[0547] 将2-甲基丙酸[[5-[3-氯-2-[2-(4-氰基苯基)乙基]-6-氟-苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-吡嗪-4-基]酯(400mg, 0.855mmol)溶解在乙醇(6mL)中。将混合物用氢氧化锂(108mg, 2.56mmol)在水(2mL)中的溶液进行处理。将反应在室温下搅拌2h。

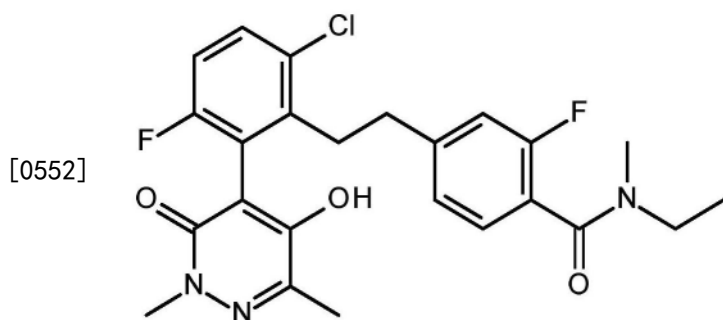
[0548] 将反应混合物在真空中浓缩以除去乙醇。将剩余的水溶液用水(15mL)稀释,然后用2M HCl酸化至大约pH 3,并且用DCM(3×10mL)萃取。将合并的有机物经MgSO<sub>4</sub>干燥、过滤并在真空中浓缩以提供粗产物。

[0549] 将粗产物通过硅胶柱色谱法(洗脱液,乙酸乙酯/己烷梯度)纯化以给出呈白色固体的4-[2-[6-氯-3-氟-2-(5-羟基-2,6-二甲基-3-氧代-吡嗪-4-基)苯基]乙基]苯甲腈(83mg, 91%产率, A-1.036)。



2H) 7.26-7.31 (m, 1H) 7.08 (d, J=8.19Hz, 2H) 6.86 (t, J=8.50Hz, 1H) 3.63 (s, 3H) 2.61-2.77 (m, 4H) 2.24 (s, 3H)。

[0551] 实例4 4-[2-[6-氯-3-氟-2-(5-羟基-2,6-二甲基-3-氧代-吡嗪-4-基)苯基]乙基]-N-乙基-2-氟-N-甲基-苯甲酰胺(A-1.028)的制备



[0553] 4.1 2-甲基丙酸[5-[3-氯-6-氟-2-[(E)-2-(6-甲基-4,8-二氧代-1,3,6,2-二氧氮硼杂八环-2-基)乙烯基]苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-吡嗪-4-基]酯

[0554] 将2-甲基-丙酸[5-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)-1,3-二甲基-6-氧代-吡嗪-4-基]酯(5.00g, 11.97mmol, 1.0当量)、6-甲基-2-乙烯基-1,3,6,2-二氧氮硼杂八环-4,8-二酮(2.63g, 14.36mmol, 1.2当量)和氯[(三叔丁基膦)-2-(2-氨基联苯基)]钯(II)(307mg, 0.60mmol, 0.05当量)装入装配有冷凝器、搅拌棒和氮气鼓泡器的250ml圆底烧瓶中。添加THF(100mL),接着针对氮气流添加N,N-二异丙基乙胺(4.2mL, 23.94mmol, 2.0当量)并将混合物加热至回流持续3h。

[0555] 将反应混合物冷却至室温,然后在DCM中稀释并通过**Celite®**过滤,用另外部分的DCM洗涤。然后将洗脱液浓缩至干燥。

[0556] 将粗产物通过快速柱色谱法进行纯化,以得到呈灰白色固体的2-甲基丙酸[5-[3-氯-6-氟-2-[(E)-2-(6-甲基-4,8-二氧代-1,3,6,2-二氧氮硼杂八环-2-基)乙烯基]苯基]-



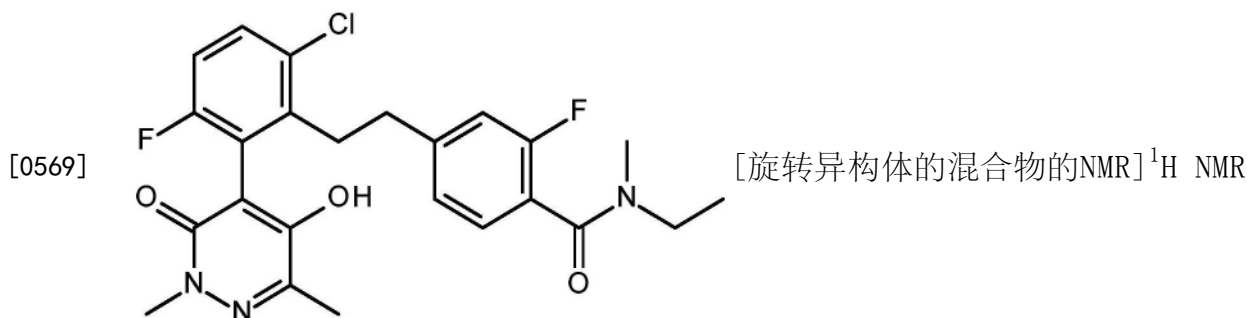
7.5Hz, 0.5H), 6.99 (t, J=8.9Hz, 1H), 6.96 (dd, J=1.2, 7.5Hz, 1H), [6.89 (dd, J=1.2, 6.9Hz, 1H), 6.86 (dd, J=1.2, 6.9Hz, 1H)], 3.85 (s, 3H), [3.59 (q, J=7.4Hz, 1H), 3.24 (q, J=7.4Hz, 1H)], [3.08 (s, 1.5H), 2.90 (br s, 1.5H)], 2.88-2.78 (m, 3H), 2.75-2.64 (m, 1H), 2.55 (spt, J=7.0Hz, 1H), 2.26 (s, 3H), [1.23 (t, J=7.2Hz, 1.5H), 1.10 (t, J=7.2Hz, 1.5H)], 0.98 (d, J=7.0Hz, 3H), 0.96 (d, J=7.1Hz, 3H)

[0565] 4.3 4-[2-[6-氯-3-氟-2-(5-羟基-2,6-二甲基-3-氧代-咪唑-4-基)苯基]乙基]-N-乙基-2-氟-N-甲基-苯甲酰胺 (A-1.028)

[0566] 将2-甲基丙酸[5-[3-氯-2-[2-[4-[乙基(甲基)氨基甲酰基]-3-氟-苯基]乙基]-6-氟-苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-咪唑-4-基]酯(300mg, 0.55mmol)溶解于乙醇(3mL)中。将混合物用氢氧化锂(69mg, 1.65mmol)在水(3mL)中的溶液进行处理。将反应在室温下搅拌2h。

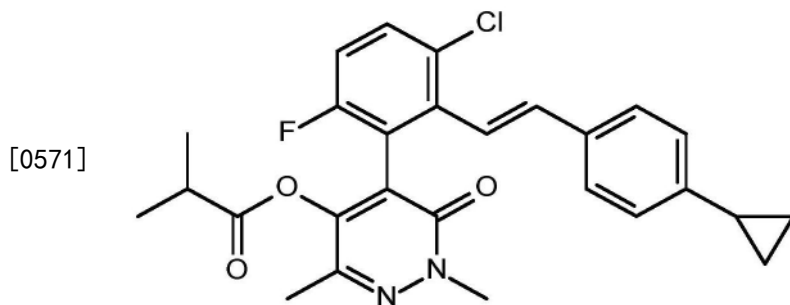
[0567] 将反应混合物在真空中浓缩以除去乙醇。将剩余的水溶液用水(15mL)稀释,然后用2M HCl酸化至大约pH 3,并且用DCM(3×10mL)萃取。将合并的有机物干燥并在真空中浓缩以得到粗产物。

[0568] 将粗产物通过硅胶柱色谱法(洗脱液, DCM/甲醇梯度)纯化以给出呈白色固体的4-[2-[6-氯-3-氟-2-(5-羟基-2,6-二甲基-3-氧代-咪唑-4-基)苯基]乙基]-N-乙基-2-氟-N-甲基-苯甲酰胺(224mg, 86%产率, A-1.028)。



(400MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ=10.86 (br s, 1H), 7.55-7.49 (m, 1H), 7.25-7.19 (m, 2H), 6.95-6.89 (m, 2H), 3.61 (s, 3H), 3.46 (q, J=7.1Hz, 1H), 3.12 (q, J=7.1Hz, 1H), 2.95 (s, 1.5H), 2.78 (s, 1.5H), 2.78-2.63 (m, 4H), 2.26 (s, 3H), 1.11 (t, J=7.1Hz, 1.5H), 1.00 (t, J=7.1Hz, 1.5H)。

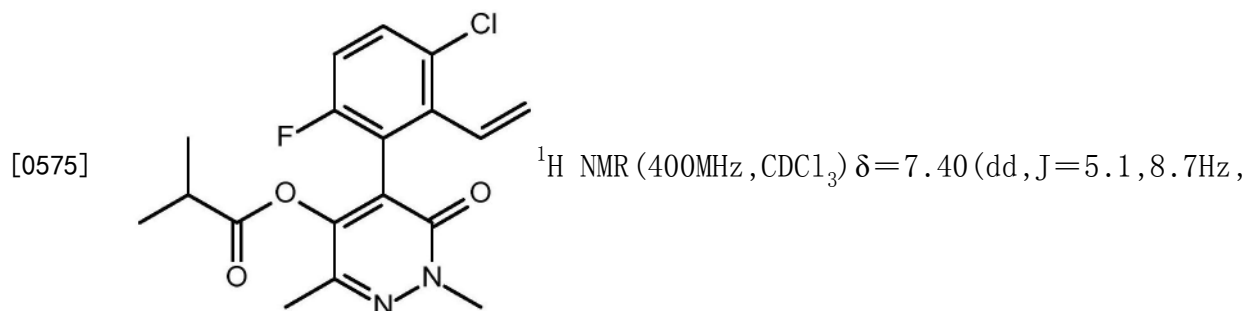
[0570] 实例5 2-甲基丙酸[5-[3-氯-2-[(E)-2-(4-环丙基苯基)乙烯基]-6-氟-苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-咪唑-4-基]酯 (A-4.038)的制备



[0572] 5.1 2-甲基丙酸[5-(3-氯-6-氟-2-乙烯基-苯基)-1,3-二甲基-6-氧代-咪唑-4-基]酯

[0573] 将2-甲基丙酸[5-(2-溴-3-氯-6-氟-苯基)-1,3-二甲基-6-氧代-哒嗪-4-基]酯(4.177g, 10.00mmol, 1.0当量)和三丁基(乙烯基)锡烷(4.384mL, 15.00mmol, 1.50当量)溶解于甲苯(60.00mL)中,然后添加1,1-双(二苯基膦基)二茂铁]二氯化钯(II)二氯甲烷络合物[PdCl<sub>2</sub>(dppf)·DCM](408mg, 0.50mmol, 0.05当量)。将反应混合物在回流下加热过夜。

[0574] 将反应混合物冷却至室温,然后在真空中浓缩。然后将粗产物通过快速柱色谱法纯化以得到呈灰白色固体的2-甲基丙酸[5-(3-氯-6-氟-2-乙烯基-苯基)-1,3-二甲基-6-氧代-哒嗪-4-基]酯(3.02g, 83%产率)。



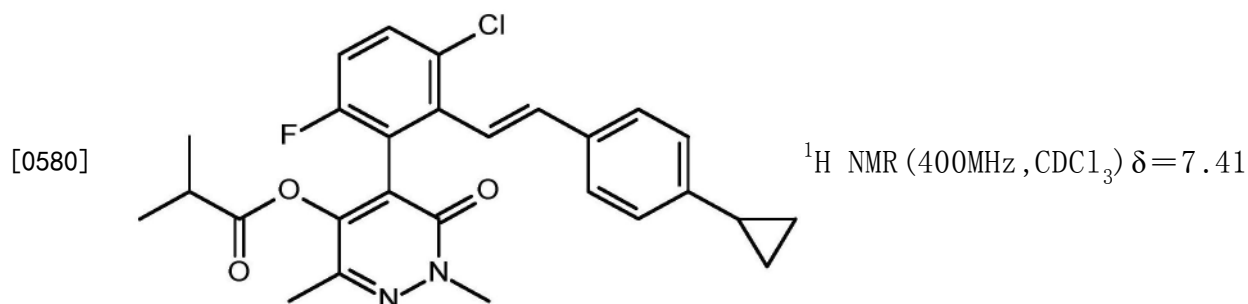
1H), 6.99 (t, J=8.7Hz, 1H), 6.65 (dd, J=11.6, 17.6Hz, 1H), 5.37-5.30 (m, 2H), 3.79 (s, 3H), 2.59 (spt, J=7.0Hz, 1H), 2.23 (s, 3H), 1.04 (d, J=7.0Hz, 4H), 1.03 (d, J=7.0Hz, 1H)

[0576] 5.2 2-甲基丙酸[5-[3-氯-2-[(E)-2-(4-环丙基苯基)乙烯基]-6-氟-苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-哒嗪-4-基]酯(A-4.038)

[0577] 将在氮气下的2-甲基丙酸[5-(3-氯-6-氟-2-乙烯基-苯基)-1,3-二甲基-6-氧代-哒嗪-4-基]酯(300mg, 1.0当量)、氯[(三叔丁基膦)-2-(2-氨基联苯基)]钯(II)(21mg, 0.05当量)、1-溴-4-环丙基苯(243mg, 1.5当量)和N,N-二异丙基乙胺(0.29mL, 2.0当量)在甲苯(5mL)中的搅拌混合物在回流下加热3h。

[0578] 将反应混合物冷却至室温,然后将其用DCM稀释并通过硅藻土垫过滤,用另外部分的DCM洗脱。在真空中浓缩滤液以给出粗产物。

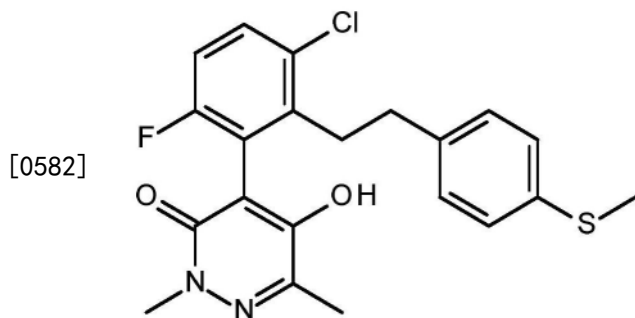
[0579] 将粗产物通过快速柱色谱法纯化以给出呈淡黄色胶状物的2-甲基丙酸[5-[3-氯-2-[(E)-2-(4-环丙基苯基)乙烯基]-6-氟-苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-哒嗪-4-基]酯(285mg, 72%产率)。



(dd, J=5.1, 8.9Hz, 1H), 7.26-7.22 (m, 2H), 7.02-6.98 (m, 2H), 6.99 (t, J=8.9Hz, 1H), 6.93 (d, J=16.5Hz, 1H), 6.59 (d, J=16.5Hz, 1H), 3.71 (s, 3H), 2.62 (spt, J=7.0Hz, 1H), 2.19 (s, 3H), 1.87 (tt, J=5.0, 8.4Hz, 1H), 1.07 (d, J=7.0Hz, 3H), 1.06 (d, J=7.0Hz, 1H), 0.99-0.93 (m, J=2.0, 8.4Hz, 2H), 0.73-0.64 (m, 2H)。

[0581] 实例6 4-[3-氯-6-氟-2-[2-(4-甲基硫烷基苯基)乙基]-苯基]-5-羟基-2,6-二甲

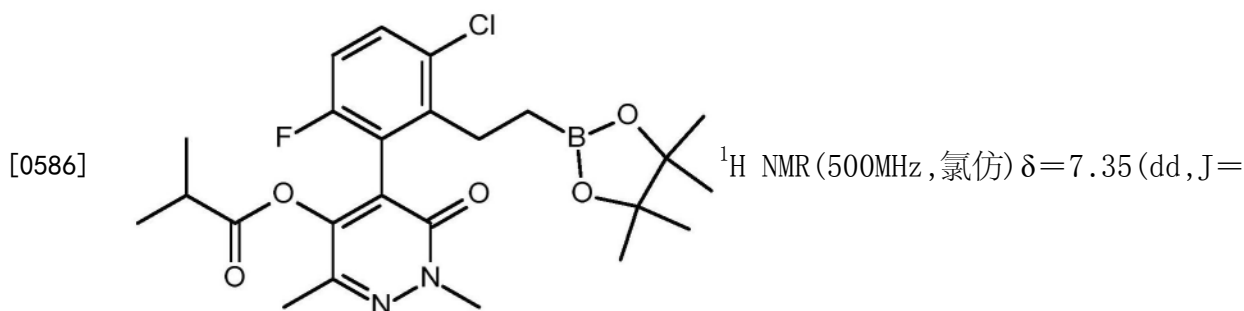
基-吡嗪-3-酮(A-1.039)的制备



[0583] 6.1 2-甲基丙酸[5-[3-氯-6-氟-2-[2-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基)乙基]苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-吡嗪-4-基]酯

[0584] 将经烘箱干燥的圆底烧瓶然后装入Ir(COD)Cl<sub>2</sub> (299mg, 0.45mmol) 和4-二苯基磷烷基丁基(二苯基)磷烷(0380mg, 0.89mmol)。将烧瓶排空并回填氮气(x3), 然后添加THF(75mL)并将反应在室温下搅拌30min。逐滴地添加2-甲基丙酸[5-(3-氯-6-氟-2-乙基-苯基)-1,3-二甲基-6-氧代-吡嗪-4-基]酯[如在实例4中所述的制备](6.7g, 17.8mmol)在THF中的溶液并将混合物搅拌10min, 接着逐滴地添加4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷(3.02mL, 20.8mmol)。将反应在60°C下搅拌过夜。

[0585] 24h后, 将反应冷却至室温, 然后在真空中浓缩。将粗产物通过硅胶柱色谱法(用环己烷/乙酸乙酯梯度洗脱)纯化以给出呈黄色固体的2-甲基丙酸[5-[3-氯-6-氟-2-[2-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基)乙基]苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-吡嗪-4-基]酯(4.50g, 51%产率)。



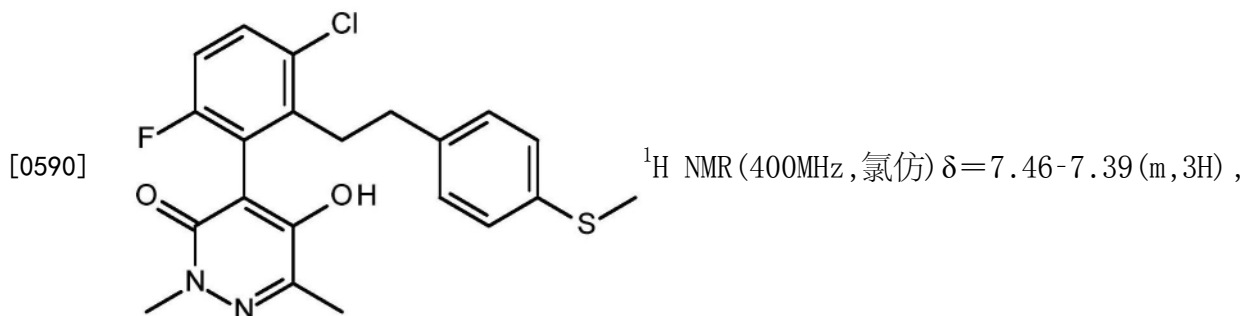
5.2, 8.9Hz, 1H), 6.90 (t, J=8.6Hz, 1H), 3.81 (s, 3H), 2.59 (t, J=8.5Hz, 2H), 2.53 (spt, J=7.0Hz, 1H), 2.24 (s, 3H), 1.32-1.16 (m, 12H), 1.08-1.00 (m, 2H), 0.98 (d, J=7.0Hz, 3H), 0.94 (d, J=7.0Hz, 3H)。

[0587] 6.2 4-[3-氯-6-氟-2-[2-(4-甲基硫烷基苯基)乙基]苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-吡嗪-3-酮(A-1.039)

[0588] 将2-甲基丙酸[5-[3-氯-6-氟-2-[2-(4,4,5,5-四甲基-1,3,2-二氧杂环戊硼烷-2-基)乙基]苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-吡嗪-4-基]酯(100mg, 0.20mmol)、1-溴-4-甲基硫烷基-苯(62mg, 0.30mmol)、氯(2-二环己基膦基-2',6'-二异丙氧基-1,1'-联苯基)[2-(2'-氨基-1,1'-联苯基)]钯(II)(24mg, 0.03mmol)、K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>(84mg, 0.61mmol)、1,4-二噁烷(2mL)和水(0.2mL)在5mL的微波小瓶中合并。然后在微波辐射下, 将反应混合物在140°C下加热90分钟。

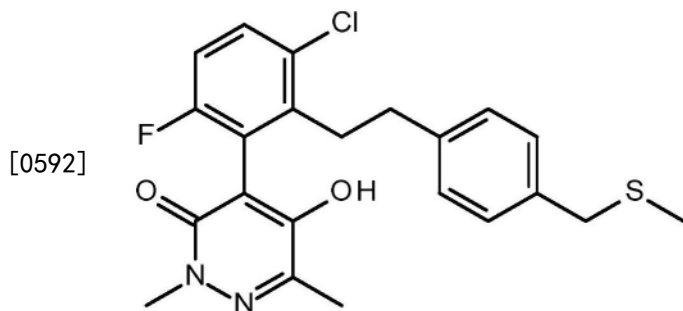
[0589] 将反应混合物冷却至室温, 然后用水(10mL)稀释, 用2M HCl酸化至大约pH 3并用

DCM(4x) 萃取。将合并的有机物在真空中浓缩以给出粗产物,将其通过质量定向的反相HPLC 纯化以得到呈白色固体的4-[3-氯-6-氟-2-[2-(4-甲基硫烷基苯基)乙基]苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-哒嗪-3-酮(22mg,22%产率,A-1.039)。



7.12 (d,  $J=8.0\text{Hz}$ , 2H), 6.98 (t,  $J=8.6\text{Hz}$ , 1H), 6.90 (d,  $J=8.0\text{Hz}$ , 2H), 3.73 (s, 3H), 2.84-2.64 (m, 4H), 2.45 (s, 3H), 2.29 (s, 3H)。

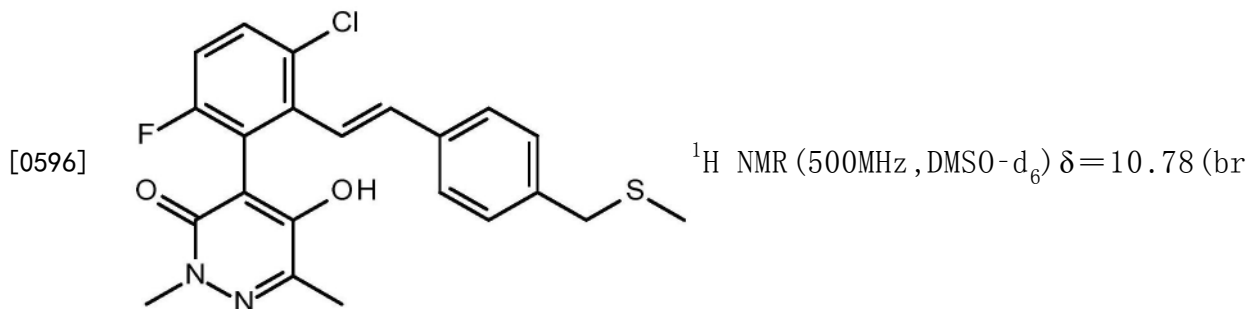
[0591] 实例7 4-[3-氯-6-氟-2-[2-[4-(甲基硫烷基甲基)苯基]乙基]苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-哒嗪-3-酮(A-1.388)的制备



[0593] 7.1 4-[3-氯-6-氟-2-[(E)-2-[4-(甲基硫烷基甲基)苯基]乙烯基]苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-哒嗪-3-酮

[0594] 将2-甲基丙酸[5-[3-氯-6-氟-2-[(E)-2-(6-甲基-4,8-二氧代-1,3,6,2-二氧氮硼杂八环-2-基)乙烯基]苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-哒嗪-4-基]酯(500mg,0.96mmol)、1-溴-4-(甲基硫烷基甲基)苯(324mg,1.44mmol)、1,1-双(二苯基膦基)二茂铁]二氯钯(II)二氯甲烷络合物[PdCl<sub>2</sub>(dppf).DCM](41mg,0.05mmol)和碳酸钾(417mg,2.89mmol)在氮气气氛下添加到10-20ml微波小瓶中。添加经脱气的乙腈(11.5mL)和水(2.9mL)并将混合物在微波辐射下加热至150°C持续20min。

[0595] 将反应混合物浓缩至干燥。将残余物用水(20ml)处理,并通过添加2M HCl将水相酸化至pH 3,导致形成沉淀物。添加DCM(20ml)以溶解所述沉淀物。添加盐水(20ml)并且分离相。将水相用另外的两部分的DCM萃取,然后将合并的有机萃取物干燥并直接浓缩到二氧化硅上。将粗材料通过自动硅胶快速色谱法(用环己烷/乙酸乙酯梯度洗脱)纯化以给出呈灰白色固体的4-[3-氯-6-氟-2-[(E)-2-[4-(甲基硫烷基甲基)苯基]乙烯基]苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-哒嗪-3-酮(341mg,82%产率)。

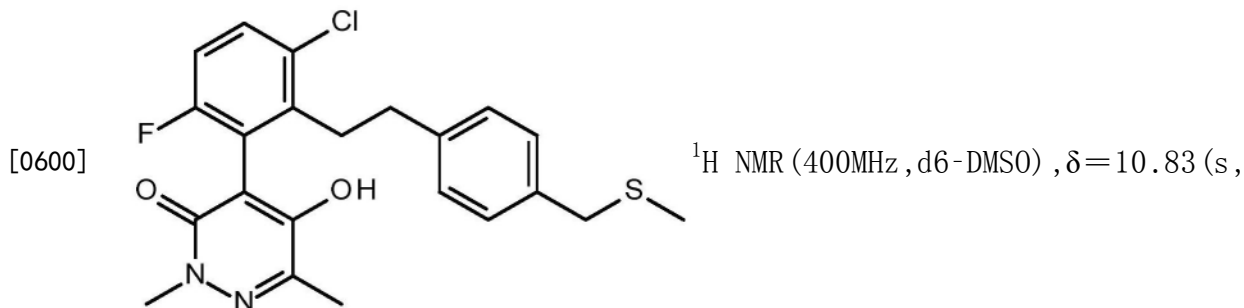


s, 1H), 7.60 (dd,  $J=5.2, 8.7\text{Hz}$ , 1H), 7.30-7.24 (m, 5H), 6.93 (d,  $J=16.5\text{Hz}$ , 1H), 6.56 (d,  $J=16.5\text{Hz}$ , 1H), 3.67 (s, 2H), 3.54 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.94 (s, 3H)

[0597] 7.2 4-[3-氯-6-氟-2-[2-[4-(甲基硫烷基甲基)苯基]乙基]苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-咪嗪-3-酮(A-1.388)

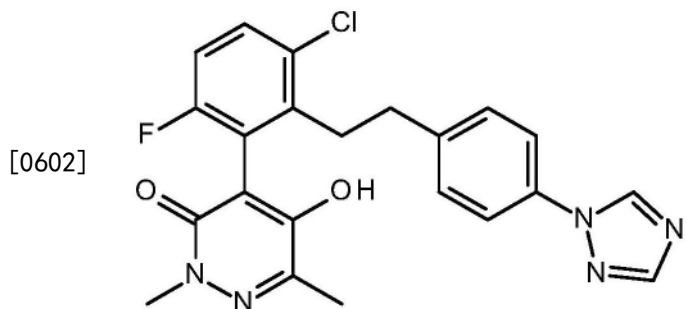
[0598] 向氮气氛下的4-[3-氯-6-氟-2-[(E)-2-[4-(甲基硫烷基甲基)苯基]乙烯基]苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-咪嗪-3-酮(335mg, 0.78mmol)在四氢呋喃(12ml)中的溶液中添加N,N-二异丙基乙胺(1.08ml, 6.20mmol)。将搅拌的反应混合物加热至70°C并将2,4,6-三异丙基苯磺酰基酰肼(2.06g, 6.21mmol)在6h内分批添加,然后将混合物加热至回流持续16h。将额外的N,N-二异丙基乙胺(0.68ml, 3.89mmol)添加到反应混合物中,接着添加2,4,6-三异丙基苯磺酰基酰肼(1.29g, 3.89mmol),并将混合物加热至回流持续另外的6h。

[0599] 将反应混合物冷却至室温,然后直接浓缩到二氧化硅上。将粗材料通过自动硅胶快速色谱法(用环己烷/乙酸乙酯梯度洗脱)部分纯化。将所获得的材料通过质量定向的反相HPLC进一步纯化以得到呈白色固体的4-[3-氯-6-氟-2-[2-[4-(甲基硫烷基甲基)苯基]乙基]苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-咪嗪-3-酮(208mg, 62%产率, A-1.388)



1H), 7.56-7.53 (m, 1H), 7.23-7.16 (m, 3H), 6.96-6.94 (d, 2H), 3.62 (s, 2H), 3.60 (s, 3H), 2.68-2.54 (m, 4H), 2.26 (s, 3H), 1.92 (s, 3H)

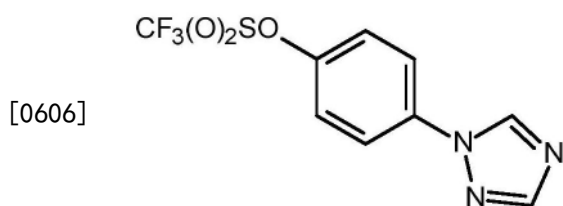
[0601] 实例8 4-[3-氯-6-氟-2-[2-[4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基]乙基]苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-咪嗪-3-酮(A-1.385)



[0603] 8.1 三氟甲烷磺酸[4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基]酯

[0604] 将4-(1,2,4-三唑-1-基)苯酚(1.22g, 7.57mmol)在氮气下溶解于二氯甲烷(10ml)中并冷却至大约0°C。在大约2min内逐滴地添加吡啶(1.22ml, 15.1mmol)在二氯甲烷(5ml)中的溶液。将混合物搅拌5分钟,然后在大约2分钟内逐滴地添加三氟甲烷磺酸酐(1.53ml, 9.08mmol)在二氯甲烷(5ml)中的溶液。移除冷却,并将反应混合物升温至室温,然后在室温下搅拌16h。

[0605] 将反应通过添加2M水性HCl(20ml)淬灭,然后分离有机相。将水相用二氯甲烷(2×20ml)进一步萃取。将合并的有机物用水(20ml)洗涤、干燥、然后在减压下浓缩以给出奶油色固体。将粗材料通过自动硅胶快速色谱法(用环己烷/乙酸乙酯梯度洗脱)纯化以给出呈白色固体的三氟甲烷磺酸[4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基]酯(2.02g, 91%产率)。



[0607]  $^1\text{H}$  NMR (400MHz, 氯仿)  $\delta$ =8.59(s, 1H), 8.14(s, 1H), 7.86-7.78(m, 2H), 7.50-7.41(m, 2H)。

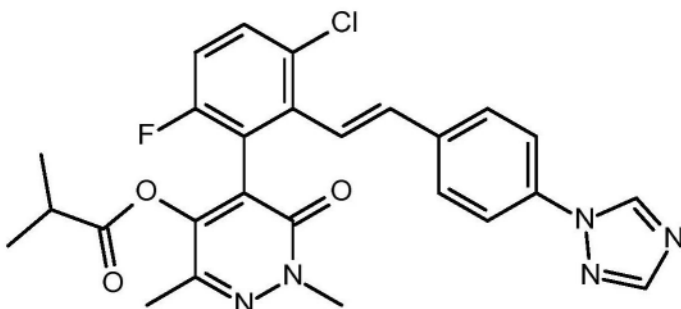
[0608] 8.2 2-甲基丙酸[5-[3-氯-6-氟-2-[(E)-2-[4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基]乙烯基]苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-哒嗪-4-基]酯

[0609] 将2-甲基丙酸[5-[3-氯-6-氟-2-[(E)-2-(6-甲基-4,8-二氧代-1,3,6,2-二氧氮硼杂八环-2-基)乙烯基]苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-哒嗪-4-基]酯(500mg, 0.96mmol)、1,1-双(二苯基膦基)二茂铁]二氯钯(II)二氯甲烷络合物[PdCl<sub>2</sub>(dppf)]·DCM(39mg, 0.048mmol)、三氟甲烷磺酸[4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基]酯(367mg, 1.25mmol)和磷酸钾(834mg, 3.85mmol)添加到10-20ml微波小瓶中。

[0610] 添加四氢呋喃(10ml)和水(0.5ml),然后在真空下通过搅拌将反应混合物脱气,然后回填氮气(X3)。将反应混合物在微波辐射下在120°C微波中加热60min。

[0611] 将反应混合物通过 **Celite®** 塞过滤,用EtOAc和EtOH洗涤。将滤液在减压下浓缩以给出棕色胶状物(840mg)。将粗材料通过自动硅胶快速色谱法(用环己烷/乙酸乙酯梯度洗脱)纯化以给出淡黄色胶状物(389mg)。将经纯化的材料溶解于乙腈(10ml)并在室温下用 SiliCycle **SiliaMetS®** 硫醇(SH)金属清除剂树脂(365mg)进行处理。将悬浮液在室温下搅拌3h,然后过滤以除去树脂,用另外的乙腈洗涤。将滤液在真空中浓缩以提供呈无色胶状物的2-甲基丙酸[5-[3-氯-6-氟-2-[(E)-2-[4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基]乙烯基]苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-哒嗪-4-基]酯(361mg, 73%产率)。

[0612]

 $^1\text{H NMR}$  (400MHz, 氯仿)  $\delta$  ppm

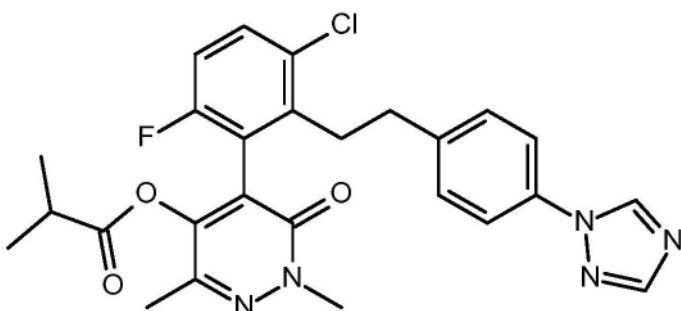
8.55 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.60-7.66 (m, 2H), 7.42-7.53 (m, 3H), 7.01-7.10 (m, 2H), 6.69 (d,  $J=16.5\text{Hz}$ , 1H), 3.70 (s, 3H), 2.66 (spt,  $J=7.0\text{Hz}$ , 1H), 2.23 (s, 3H), 1.11 (d,  $J=7.0\text{Hz}$ , 1H), 1.08 (d,  $J=7.1\text{Hz}$ , 1H)

[0613] 8.3 2-甲基丙酸[5-[3-氯-6-氟-2-[2-[4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基]乙基]苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-咪嗪-4-基]酯 (A-3.385)

[0614] 使2-甲基丙酸[5-[3-氯-6-氟-2-[(E)-2-[4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基]乙烯基]苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-咪嗪-4-基]酯 (365mg, 0.72mmol) 在3巴 $\text{H}_2$ 下在EtOAc (10mL) 中在5%Pd/C (50%湿) 催化剂 (0.15g) 上经受催化氢化持续24h。

[0615] 将反应混合物通过**Celite®**垫过滤,用乙酸乙酯洗涤。将滤液在真空中浓缩以得到粗残余物 (350mg),将其吸附到二氧化硅上并通过自动硅胶快速色谱法(用环己烷/乙酸乙酯梯度洗脱)纯化。获得了呈无色胶状物的2-甲基丙酸[5-[3-氯-6-氟-2-[2-[4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基]乙基]苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-咪嗪-4-基]酯 (A-3.385) (321mg, 88%产率)。

[0616]

 $^1\text{H NMR}$  (400MHz, 氯仿)  $\delta=8.51$ 

(s, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.55 (d,  $J=8.2\text{Hz}$ , 2H), 7.43 (dd,  $J=5.2, 8.7\text{Hz}$ , 1H), 7.27 (d,  $J=8.2\text{Hz}$ , 2H), 7.00 (t,  $J=8.7\text{Hz}$ , 1H), 3.84 (s, 3H), 2.97-2.80 (m, 3H), 2.79-2.67 (m, 1H), 2.55 (spt,  $J=7.0\text{Hz}$ , 1H), 2.25 (s, 3H), 0.98 (d,  $J=7.0\text{Hz}$ , 3H), 0.96 (d,  $J=7.0\text{Hz}$ , 1H)

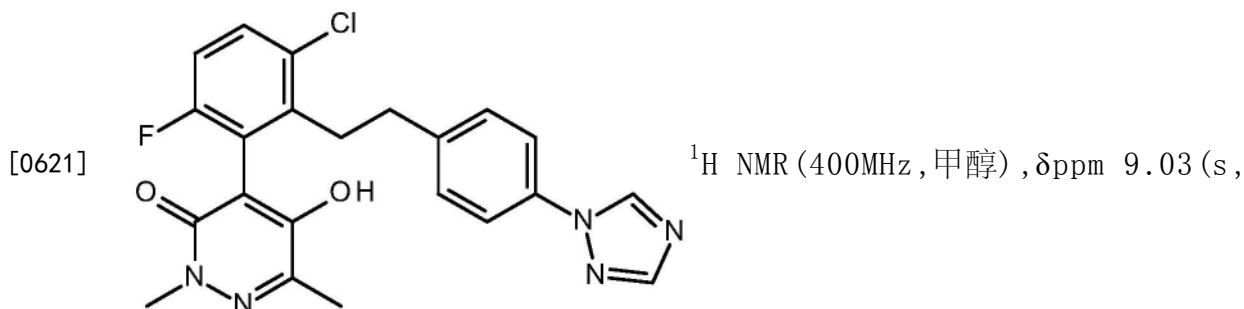
[0617] 8.4 4-[3-氯-6-氟-2-[2-[4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基]乙基]苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-咪嗪-3-酮 (A-1.385)

[0618] 在室温下在乙醇 (5ml) 中搅拌2-甲基丙酸[5-[3-氯-6-氟-2-[2-[4-(1,2,4-三唑-1-基)苯基]乙基]苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-咪嗪-4-基]酯 (320mg, 0.63mmol)。

[0619] 逐滴地添加氢氧化锂一水合物 (81mg, 1.88mmol) 在水中 (2ml) 的溶液,并将反应在室温下搅拌1h。

[0620] 将乙醇溶剂在减压下除去,然后用水 (20ml) 稀释残余物。通过添加2M HCl (水性) 将水相酸化至大约pH 3-4,然后将其用EtOAc (3×10ml) 萃取。将合并的有机萃取物在减压下浓缩以给出白色固体 (292mg)。将粗残余物通过自动硅胶快速色谱法(用环己烷/乙酸乙

酯和乙酸乙酯/乙醇梯度洗脱) 纯化, 以得到呈白色固体的4-[3-氯-6-氟-2-[2-[4-(1,2,4-三唑-1-基) 苯基] 乙基] 苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-吡嗪-3-酮(A-1.365) (260mg, 94% 产率)。



1H), 8.14 (s, 1H), 7.65-7.70 (m, 2H), 7.51 (dd,  $J=5.2, 8.7\text{Hz}$ , 1H), 7.20 (m, 2H), 7.11 (t,  $J=8.7\text{Hz}$ , 1H), 3.72 (s, 3H), 2.72-2.89 (m, 4H), 2.32 (s, 3H)

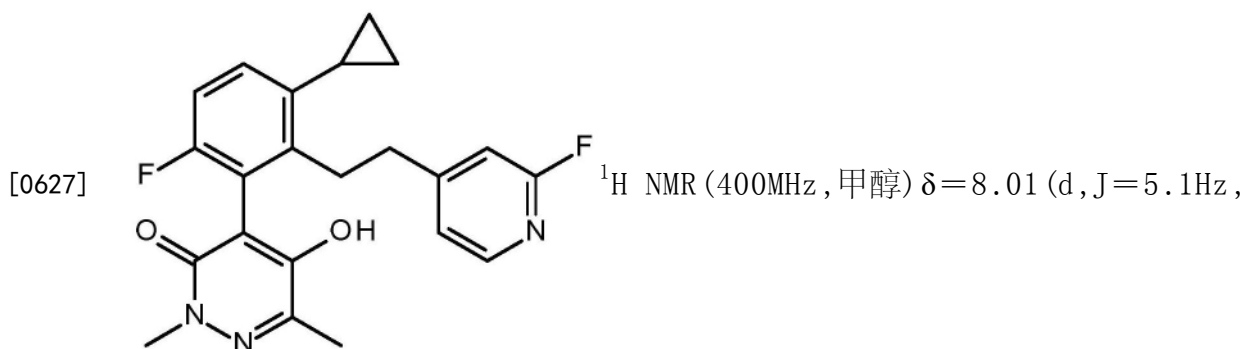
[0622] 实例9 4-[3-环丙基-6-氟-2-[2-(2-氟-4-吡啶基) 乙基] 苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-吡嗪-3-酮(C-1.013)

[0623] 将2-甲基丙酸[5-[3-氯-6-氟-2-[2-(2-氟-4-吡啶基) 乙基] 苯基]-1,3-二甲基-6-氧代-吡嗪-4-基]酯(250mg, 0.54mmol)、磷酸三钾一水合物(374mg, 1.62mmol)和RuPhos Pd G2(42mg, 0.05mmol)装入配备有搅拌棒的2-5ml微波小瓶中。将反应容器排空并回填氮气(X3)。添加1,4-二噁烷(4ml), 接着添加环丙基硼酸(139mg, 1.62mmol)和水(1ml) (均为经脱气的溶剂)。然后将混合物在微波辐射下加热至120°C持续1h。

[0624] 将反应冷却至室温, 然后添加额外的环丙基硼酸(139mg, 1.62mmol)和RuPhos Pd G2(42mg, 0.05mmol), 并将反应加热至120°C持续另外的2.5小时。

[0625] 将反应混合物在真空中浓缩以除去二噁烷。将残余物用水(20ml)和DCM(20mL)稀释, 并分离层。将水相用另外部分的DCM(3×5ml)萃取, 然后将合并的有机萃取物干燥并浓缩以给出深色固体(331mg)。

[0626] 将粗残余物通过质量定向的反相HPLC纯化以得到呈白色固体的4-[3-环丙基-6-氟-2-[2-(2-氟-4-吡啶基) 乙基] 苯基]-5-羟基-2,6-二甲基-吡嗪-3-酮(C-1.013)

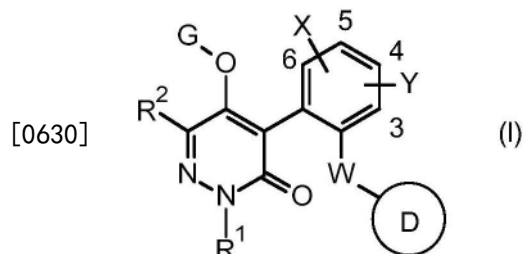


1H), 7.13 (dd,  $J=5.6, 8.3\text{Hz}$ , 1H), 7.02-6.93 (m, 2H), 6.72 (br s, 1H), 3.72 (s, 3H), 3.02-2.75 (m, 4H), 2.32 (s, 3H), 1.97-1.87 (m, 1H), 1.02-0.89 (m, 2H), 0.74-0.61 (m, 2H)

[0628] 使用如上所述的通用方法制备化合物A-1.023、A-1.024、A-1.025、A-1.026、A-1.027、A-1.028、A-1.029、A-1.030、A-1.031、A-1.032、A-1.033、A-1.034、A-1.035、A-1.036、A-1.037、A-1.038、A-1.039、A-1.040、A-1.041、A-1.042、A-1.043、A-1.044、A-

2.027、A-2.030、A-2.037、A-3.028、A-3.029、A-3.030、A-3.035、A-3.036、A-3.038、A-4.029、A-4.030、A-4.035、A-4.036、A-1.373、A-1.374、A-1.375、A-1.376、A-1.377、A-1.378、A-1.379、A-1.380、A-1.381、A-1.382、A-1.383、A-1.384、A-1.386、A-1.387、A-1.389、A-1.390、A-1.391以及A-1.392。下表4示出了这些化合物的结构和NMR表征数据。

[0629] 表4具有式(I)的化合物的制备实例。用于描述X和Y的位置的编号系统仅为清楚起见而示出。



[0631]

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
A-1.023	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-噁唑-5- 基苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 甲醇) δ = 8.22 (s, 1H), 7.63 - 7.56 (m, 2H), 7.51 (dd, J = 5.2, 8.9 Hz, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.14 - 7.07 (m, 3H), 3.72 (s, 3H), 2.86 - 2.66 (m, 4H), 2.32 (s, 3H)。
A-1.024	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-乙酰胺 基苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 甲醇) δ = 7.50 (dd, J = 5.3, 8.6 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.09 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 6.94 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 3.72 (s, 3H), 2.74 (s, 4H), 2.33 (s, 3H), 2.09 (s, 3H)
A-1.025	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-(二甲基 氨磺酰 基)苯基-	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ = 10.86 (br s, 1H), 7.62 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.53 (dd, J = 5.2, 8.8 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.22

[0632]

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
								(t, J = 8.8 Hz, 1H), 3.61 (s, 3H), 2.83 - 2.64 (m, 4H), 2.57 (s, 6H), 2.26 (s, 3H)
A-1.026	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-叔丁基 苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ = 10.86 (br s, 1H), 7.57 (dd, J = 5.1, 8.9 Hz, 1H), 7.28 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.22 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 3.62 (s, 3H), 2.70 - 2.53 (m, 4H), 2.27 (s, 3H), 1.24 (s, 9H)
A-1.027	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-联苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.57 - 7.52 (m, 2H), 7.50 - 7.40 (m, 5H), 7.37 - 7.30 (m, 1H), 7.07 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.02 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 5.47 (s, 1H), 3.75 (s, 3H), 2.88 - 2.80 (m, 3H), 2.27 (s, 3H)
A-1.028	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-[乙基 (甲基)氨基 基甲酰 基]-3-氟- 苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ = 10.86 (br s, 1H), 7.55 - 7.49 (m, 1H), 7.25 - 7.19 (m, 2H), 6.95 - 6.89 (m, 2H), 3.61 (s, 3H), 3.46 (q, J = 7.1 Hz, 1H), 3.12 (q, J = 7.1 Hz, 1H), 2.95 (s, 1.5H), 2.78 (s, 1.5H), 2.78 - 2.63 (m, 4H), 2.26 (s, 3H), 1.11 (t, J = 7.1 Hz, 1.5H), 1.00 (t, J = 7.1 Hz,

[0633]

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
A-1.029	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	2-氟基苯 基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.51 - 7.44 (m, 2H), 7.33 - 7.24 (m, 3H + CHCl <sub>3</sub> 峰), 6.95 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 3.69 (s, 3H), 2.95 - 2.79 (m, 4H), 2.30 (s, 3H)。
A-1.030	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	3-氟基苯 基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.46 (td, J = 1.4, 7.6 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 5.2, 8.9 Hz, 1H), 7.35 - 7.28 (m, 2H), 7.26 - 7.23 (m, 1H), 6.95 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 3.69 (s, 3H), 2.82 - 2.63 (m, 4H), 2.28 (s, 3H)。
A-1.031	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-氨基-3- 甲基苯基 -	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ ppm 2.09 (s, 3 H) 2.27 (s, 3 H) 2.50 - 2.83 (m, 4 H) 3.70 (s, 3 H) 6.52 (d, J=7.83 Hz, 1 H) 6.59 - 6.73 (m, 2 H) 6.93 (t, J=8.56 Hz, 1 H) 7.38 (dd, J=8.86, 5.20 Hz, 1 H)
A-1.032	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-甲基磺 酰基苯基 -	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ = 10.86 (br s, 1H), 7.81 (app. d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.56 (dd, J = 5.2, 8.6 Hz, 1H), 7.29 (app. d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.23 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 3.61 (s, 3H), 3.17 (s, 3H), 2.86 -

[0634]

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
								2.63 (m, 4H), 2.26 (s, 3H)
A-1.033	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-二甲基 氨基苯基 -	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ ppm 2.27 (s, 3 H) 2.62 - 2.77 (m, 3 H) 2.80 - 2.87 (m, 1 H) 2.90 (s, 6 H) 3.72 (s, 3 H) 6.59 - 6.65 (m, 2 H) 6.86 (d, J=8.68 Hz, 2 H) 6.96 (t, J=8.56 Hz, 1 H) 7.42 (dd, J=8.80, 5.14 Hz, 1 H)
A-1.034	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-甲基氨 基苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ ppm 2.28 (s, 3 H) 2.80 (s, 7 H) 3.73 (s, 3 H) 6.49 (d, J=8.44 Hz, 2 H) 6.81 (d, J=8.44 Hz, 2 H) 6.97 (t, J=8.56 Hz, 1 H) 7.42 (dd, J=8.80, 5.14 Hz, 1 H)
A-1.035	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-叔丁氧 基苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.28 (dd, J = 5.2, 8.9 Hz, 1H), 6.82 (s, 5H), 3.62 (s, 3H), 2.73 - 2.50 (m, 4H), 2.23 (s, 3H)
A-1.036	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-氟基苯 基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm 7.46 - 7.51 (m, 2 H) 7.26 - 7.31 (m, 1 H) 7.08 (d, J=8.19 Hz, 2 H) 6.86 (t, J=8.50 Hz, 1 H) 3.63 (s, 3 H) 2.61 - 2.77 (m, 4 H) 2.24 (s, 3 H)
A-1.037	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-羟基苯 基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ = 10.82 (br s, 1H), 9.17 (s, 1H), 7.54 (dd,

[0635]

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
								J=5.2, 8.9 Hz, 1H), 7.20 (t, J=8.9 Hz, 1H), 6.82 - 6.75 (m, 2H), 6.65 - 6.60 (m, 2H), 3.61 (s, 3H), , 2.69 - 2.43 (m, 4H), 2.26 (s, 3H)
A-1.038	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-环丙基 苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.37 (dd, J=5.2, 8.8 Hz, 1H), 6.96 - 6.88 (m, 2H), 6.91 (t, J=8.8 Hz, 1H), 6.88 - 6.83 (m, 2H), 3.67 (s, 3H), 2.82 - 2.62 (m, 4H), 2.25 (s, 3H), 1.84 (tt, J=5.0, 8.5 Hz, 1H), 0.95 - 0.88 (m, 2H), 0.68 - 0.60 (m, 2H)
A-1.039	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-(甲基硫 烷基)苯 基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.46 - 7.39 (m, 3H), 7.12 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 6.98 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 6.90 (d, J = 8.0 Hz, 2H), 3.73 (s, 3H), 2.84 - 2.64 (m, 4H), 2.45 (s, 3H), 2.29 (s, 3H)
A-1.040	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-羧基苯 基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 甲醇) δ = 7.88 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.51 (dd, J = 5.2, 8.9 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.11 (t, J = 8.5 Hz, 1H), 3.74 - 3.70 (m, 3H), 2.88 - 2.70 (m, 3H), 2.34 - 2.26 (m, 3H)
A-1.041	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-甲氧基 羧基苯基	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.88 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.40

[0636]

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
							-	(dd, J = 5.2, 8.9 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 6.96 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 2.86 - 2.72 (m, 4H), 2.28 (s, 3H)
A-1.042	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-(叔丁氧基羰基氨基)-3-氟-苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 甲醇) δ = 7.66 - 7.55 (m, 1H), 7.48 (br dd, J = 5.3, 8.7 Hz, 1H), 7.08 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 6.78 - 6.71 (m, 2H), 3.72 (s, 3H), 2.82 - 2.60 (m, 4H), 2.32 (s, 3H), 1.50 (s, 9H)
A-1.043	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	2-(甲基硫烷基)-4-吡啶基-	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, 氯仿) δ ppm 2.30 (s, 3 H) 2.52 (s, 3 H) 2.69 - 2.80 (m, 1 H) 2.85 - 2.94 (m, 1 H) 2.96 - 3.09 (m, 2 H) 3.69 (s, 3 H) 6.85 (d, J=5.54 Hz, 1 H) 6.89 - 6.97 (m, 2 H) 7.35 (dd, J=8.77, 4.99 Hz, 1 H) 8.18 (d, J=5.79 Hz, 1 H)
A-1.044	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	2-乙酰胺基-4-吡啶基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ ppm 8.00 (d, J=5.26 Hz, 1 H) 7.64 (br s, 1 H) 7.37 (br s, 1 H) 7.00 (br d, J=1.10 Hz, 1 H) 6.78 (dd, J=5.26, 1.34 Hz, 1 H) 3.73 (s, 3 H) 2.97 (br d, J=9.66 Hz, 1 H) 2.73 - 2.88 (m, 3 H) 2.27 (s, 4 H) 2.16 (s, 3 H)

[0637]

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
A-2.027	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	(E)-CH =CH-	4-联苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.59 - 7.33 (m, 10H), 7.07 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 16.4 Hz, 1H), 6.70 (d, J = 16.5 Hz, 1H), 5.63 (s, 1H), 3.73 (s, 3H), 2.28 (s, 3H)
A-2.030	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	(E)-CH =CH-	3-氟苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.56 - 7.47 (m, 3H), 7.44 - 7.38 (m, 2H), 7.04 - 6.93 (m, 2H), 6.53 (d, J = 16.5 Hz, 1H), 3.64 (s, 3H), 2.25 (s, 3H)。
A-2.037	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	(E)-CH =CH-	4-羟基苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ = 10.75 (br s, 1H), 9.67 (s, 1H), 7.58 (dd, J=5.3, 8.8 Hz, 1H), 7.23 (t, J=8.8 Hz, 1H), 7.19 - 7.13 (m, 2H), 6.75 - 6.72 (m, 2H), 6.73 (d, J=16.5 Hz, 1H), 6.48 (d, J=16.5 Hz, 1H), 3.55 (s, 3H), 2.19 (s, 3H)
A-3.028	-Me	-Me	-(C =O) iPr	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-[乙基 (甲基)氨基 基甲酰 基]-3-氟- 苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.42 (dd, J = 5.1, 8.9 Hz, 1H), [7.25 (t, J = 7.2 Hz, 0.5H), 7.21 (t, J = 7.5 Hz, 0.5H)], 6.99 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 1.2, 7.5 Hz, 1H), [6.89 (dd, J = 1.2, 6.9 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 1.2, 6.9 Hz, 1H)], 3.85 (s, 3H),

[0638]

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
								[3.59 (q, J = 7.4 Hz, 1H), 3.24 (q, J = 7.4 Hz, 1H)], [3.08 (s, 1.5H), 2.90 (br s, 1.5H)], 2.88 - 2.78 (m, 3H), 2.75 - 2.64 (m, 1H), 2.55 (spt, J = 7.0 Hz, 1H), 2.26 (s, 3H), 1.23 (t, J = 7.2 Hz, 1.5H), 1.10 (t, J = 7.2 Hz, 1.5H)], 0.98 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 0.96 (d, J = 7.1 Hz, 3H)
A-3.029	-Me	-Me	-(C=O) iPr	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	2-氟基苯 基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.56 (dd, J = 1.1, 7.7 Hz, 1H), 7.51 - 7.46 (m, 1H), 7.43 (dd, J = 5.1, 8.8 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.30 - 7.26 (m, 1H + CHCl <sub>3</sub> 峰), 7.01 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.15 - 3.05 (m, 1H), 3.04 - 2.80 (m, 3H), 2.55 (spt, J = 7.0 Hz, 1H), 2.27 (s, 3H), 0.97 (dd, J = 1.1, 7.0 Hz, 6H)。
A-3.030	-Me	-Me	-(C=O) iPr	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	3-氟基苯 基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.50 - 7.46 (m, 1H), 7.46 - 7.37 (m, 3H), 7.37 - 7.31 (m, 1H), 7.00 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.00 - 2.78 (m, 3H), 2.73 - 2.63 (m, 1H), 2.55 (quin, J = 7.0 Hz, 1H), 2.26 (s, 3H), 0.97 (dd, J = 7.0, 13.5 Hz, 6H)。

[0639]

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
A-3.035	-Me	-Me	-(C =O) iPr	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-叔丁氧 基苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.40 (dd, J = 5.1, 8.8 Hz, 1H), 7.03 - 6.99 (m, 2H), 6.97 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 6.90 - 6.83 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.85 - 2.68 (m, 4H), 2.55 (spt, J = 7.0 Hz, 1H), 2.25 (s, 3H), 1.32 (s, 9H), 0.97 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 7.0 Hz, 3H)
A-3.036	-Me	-Me	-(C =O) iPr	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-氟基苯 基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.56 - 7.51 (m, 2H), 7.42 (dd, J = 5.2, 8.9 Hz, 1H), 7.26 - 7.21 (m, 2H), 7.00 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.02 - 2.92 (m, 1H), 2.91 - 2.80 (m, 2H), 2.75 - 2.65 (m, 1H), 2.54 (spt, J = 7.0 Hz, 1H), 2.25 (s, 3H), 0.98 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 0.95 (d, J = 7.0 Hz, 3H)
A-3.038	-Me	-Me	-(C =O) iPr	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-环丙基 苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.41 (dd, J=5.2, 8.8 Hz, 1H), 7.04 - 7.00 (m, 2H), 6.98 - 6.94 (m, 2H), 6.97 (t, J=8.8 Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.84 - 2.67 (m, 4H), 2.53 (spt, J=7.0 Hz, 1H), 2.24 (s, 3H), 1.85 (tt, J=5.1, 8.4 Hz, 1H), 0.96 (d, J=7.0 Hz, 3H), 0.96 (d, J=7.0 Hz, 3H),

[0640]

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
								0.94 - 0.88 (m, J=1.9, 8.5 Hz, 2H), 0.68 - 0.61 (m, 2H)
A-4.029	-Me	-Me	-(C=O) iPr	6-F	3-Cl	(E)-CH=CH-	2-氯基苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.70 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.61 - 7.53 (m, 2H), 7.46 (dd, J = 5.1, 8.9 Hz, 1H), 7.34 (dt, J = 1.0, 7.6 Hz, 1H), 7.24 (d, J = 16.5 Hz, 1H), 7.10 - 6.97 (m, 2H), 3.76 (s, 3H), 2.65 (spt, J = 7.0 Hz, 1H), 2.26 (s, 3H), 1.08 (dd, J = 3.0, 7.0 Hz, 6H)。
A-4.030	-Me	-Me	-(C=O) iPr	6-F	3-Cl	(E)-CH=CH-	3-氯基苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.63 - 7.55 (m, 2H), 7.55 - 7.50 (m, 1H), 7.48 - 7.38 (m, 2H), 7.12 - 7.00 (m, 2H), 6.65 (d, J = 16.5 Hz, 1H), 3.70 (s, 3H), 2.65 (spt, J = 7.0 Hz, 1H), 2.24 (s, 3H), 1.09 (dd, J = 7.0, 12.5 Hz, 6H)。
A-4.035	-Me	-Me	-(C=O) iPr	6-F	3-Cl	(E)-CH=CH-	4-叔丁氧基苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.41 (dd, J = 5.0, 8.6 Hz, 1H), 7.26 - 7.23 (m, 2H), 6.99 (t, J = 8.6 Hz, 1H), 6.94 - 6.90 (m, 1H), 6.91 (d, J = 16.5 Hz, 1H), 6.60 (d, J = 16.5 Hz, 1H), 3.71 (s, 3H), 2.63 (spt, J = 7.0 Hz, 1H), 2.22 (s, 3H), 1.35 (s, 9H), 1.08 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 1.06

[0641]

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
								(d, J = 7.0 Hz, 1H)
A-4.036	-Me	-Me	-(C=O) iPr	6-F	3-Cl	(E)-CH=CH-	4-氟苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.62 - 7.55 (m, 2H), 7.45 (dd, J=5.0, 8.5 Hz, 1H), 7.45 - 7.40 (m, 1H), 7.13 (d, J=16.5 Hz, 1H), 7.05 (t, J=8.5 Hz, 1H), 6.68 (d, J=16.5 Hz, 1H), 3.69 (s, 3H), 2.65 (spt, J=7.0 Hz, 1H), 2.23 (s, 3H), 1.11 (d, J=7.0 Hz, 3H), 1.07 (d, J=7.0 Hz, 3H)
A-1.373	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-(1-甲基吡啶-3-基)苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 甲醇) δ ppm 7.62 (d, J=8.3 Hz, 2H) 7.57 (d, J=2.3 Hz, 1H) 7.48 - 7.54 (m, 1H), 7.07 - 7.17 (m, 1H), 7.03 (d, J=8.3 Hz, 2H), 6.56 (d, J=2.3 Hz, 1H), 3.91 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 2.63 - 2.85 (m, 4H), 2.32 (s, 3H)
A-1.374	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-(5-甲基四唑-1-基)苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm 7.58 - 7.53 (m, 3H), 7.28 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.23 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 3.61 (s, 3H), 2.87 - 2.68 (m, 4H), 2.53 (s, 3H), 2.27 (s, 3H)
A-1.375	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-吗啉代苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm 7.55 (dd, J = 5.2, 8.8 Hz, 1H), 7.21 (t, J = 8.8

[0642]

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
								Hz, 1H), 6.89 - 6.80 (m, 4H), 3.73 - 3.69 (m, 4H), 3.61 (s, 3H), 3.05 - 3.00 (m, 4H), 2.69 - 2.49 (m, 4H), 2.26 (s, 3H)
A-1.376	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-(3-甲基 吡唑-1- 基)苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ = 10.84 (s, 1H), 8.30 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.55 (dd, J = 5.3, 8.7 Hz, 1H), 7.22 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 6.30 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 3.61 (s, 3H), 2.76 - 2.61 (m, 4H), 2.26 (s, 3H), 2.25 (s, 3H)
A-1.377	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-(3,5-二 甲基吡唑 -1-基)苯 基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ = 10.84 (br s, 1H), 7.56 (dd, J = 5.3, 8.7 Hz, 1H), 7.35 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.22 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.12 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 6.04 (s, 1H), 3.62 (s, 3H), 2.81 - 2.66 (m, 4H), 2.27 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.16 (s, 3H)
A-1.378	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-吡唑-1- 基苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ = 10.85 (s, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.77 - 7.65 (m, 3H), 7.56 (dd, J = 5.3, 8.7 Hz, 1H), 7.22 (t, J = 8.7 Hz, 1H),

[0643]

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
								7.11 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 6.52 (s, 1H), 3.61 (s, 3H), 2.78 - 2.61 (m, 4H), 2.26 (s, 3H)
A-1.379	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-吡咯-1- 基苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ = 10.85 (s, 1H), 7.56 (dd, J = 5.2, 8.7 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.31 (t, J = 2.1 Hz, 2H), 7.22 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.24 (t, J = 2.1 Hz, 2H), 3.62 (s, 3H), 2.76 - 2.60 (m, 4H), 2.27 (s, 3H)
A-1.380	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-(5-甲基 四氢吡喃 -2-基)苯 基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ = 7.42 - 7.36 (m, 1H), 7.20 - 7.14 (m, 2H), 6.96 - 6.87 (m, 3H), 4.79 - 4.71 (m, 1H), 4.16 - 4.05 (m, 1H), 2.84 - 2.62 (m, 4H), 2.27 (s, 3H), 2.29 - 2.16 (m, 1H), 2.13 - 2.02 (m, 1H), 1.92 - 1.71 (m, 1H), 1.68 - 1.49 (m, 1H), 1.33 (d, J = 6.1 Hz, 3H)
A-1.381	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-(5-甲基 -2-吡喃 基)苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ ppm 7.44 - 7.48 (m, 2H) 7.42 (dd, J=5.2, 8.8 Hz, 1H) 6.93 - 7.00 (m, 3H) 6.47 (d, J=3.2 Hz, 1H) 6.00 - 6.05 (m, 1H) 3.72 (s, 3H) 2.68 - 2.89 (m, 4H) 2.35 (s, 3H) 2.25 (s, 3H)

[0644]

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
A-1.382	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-噁唑-2- 基苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 氯仿) δ ppm 7.75 (d, J=8.2 Hz, 2H), 7.57 (s, 1H), 7.20 (dd, J=5.1, 8.8 Hz, 1H), 7.01 (d, J=8.2 Hz, 2H,) 6.84 - 6.91 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 2.74 (td, J=5.2, 12.5 Hz, 1H) 2.58 (td, J=4.9, 12.5 Hz, 1H) 2.32 - 2.42 (m, 4H) 2.11 (td, J=4.9, 12.4 Hz, 1H)
A-1.383	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-(2-甲基 噁唑-4- 基)苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 甲醇) δ ppm 7.73 (d, J=8.1 Hz, 2H), 7.55 (s, 1H), 7.51 (dd, J=5.2, 8.7 Hz, 1H), 7.11 (t, J=8.7 Hz, 1H), 7.06 (d, J=8.1 Hz, 2H), 3.73 (s, 3H), 2.65 - 2.86 (m, 7H) 2.33 (s, 3H)
A-1.384	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-(2-噻吩 基)苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, 甲醇) δ ppm 7.54 - 7.46 (m, 3H), 7.32 (d, J = 3.8 Hz, 2H), 7.10 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 3.8, 5.1 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 3.72 (s, 3H), 2.84 - 2.64 (m, 4H), 2.32 (s, 3H)
A-1.386	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	1-苯基-4- 吡唑基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm 8.20 (s, 1H), 7.78 - 7.74 (m, 2H), 7.56 (dd, J = 5.2, 8.7 Hz, 1H), 7.49 - 7.43 (m, 2H), 7.40 (s, 1H), 7.29 -

[0645]

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
								7.25 (m, 1H), 7.22 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 3.59 (s, 3H), 2.81 - 2.69 (m, 2H), 2.67 - 2.52 (m, 2H), 2.24 (s, 3H)
A-1.387	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	1-环丙基 -4-吡啶基 -	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ = 10.77 (s, 1H), 7.54 (dd, J = 5.2, 8.9 Hz, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.20 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.04 (s, 1H), 3.59 (s, 3H), 3.63 - 3.55 (m, 1H), 2.70 - 2.56 (m, 2H), 2.49 - 2.35 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 0.98 - 0.91 (m, 2H), 0.91 - 0.84 (m, 2H)
A-1.389	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-(异丙基 硫烷基甲 基)苯基-	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, d <sub>6</sub> -DMSO), δ ppm 10.82 (br. s, 1H), 7.56 - 7.52 (m, 1H), 7.23 - 7.18 (m, 3H), 6.95 - 6.93 (d, 2H), 3.69 (s, 2H), 3.60 (s, 3H), 2.76 - 2.49 (m, 5H), 2.26 (s, 3H), 1.17 (d, 6H)
A-1.390	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-(甲基氨 磺酰基) 苯基-	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, 氯仿) δ ppm 7.68 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.38 (dd, J = 5.1, 8.7 Hz, 1H), 7.17 - 7.11 (m, J = 8.2 Hz, 2H), 6.96 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 3.72 (s, 3H), 2.84 - 2.71 (m, 4H), 2.63 (s, 3H), 2.30 (s, 3H)
A-1.391	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C	4-氨磺酰	<sup>1</sup> H NMR (500 MHz, 氯仿) δ

化合物	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	G	X	Y	W	D	NMR 详情
						H <sub>2</sub> -	基苯基-	ppm 7.76 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.48 (dd, J = 5.2, 8.7 Hz, 2H), 7.15 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.05 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 3.76 (s, 3H), 2.94 - 2.72 (m, 4H), 2.32 (s, 3H)
[0646] A-1.392	-Me	-Me	-H	6-F	3-Cl	-CH <sub>2</sub> -C H <sub>2</sub> -	4-氨基甲 酰基苯基 -	<sup>1</sup> H NMR (400 MHz, DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm 10.83 (s, 1H), 7.87 (br s, 1H), 7.76 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 7.55 (dd, J = 5.3, 8.7 Hz, 1H), 7.26 (br s, 1H), 7.22 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 3.61 (s, 3H), 2.75 - 2.63 (m, 4H), 2.26 (s, 3H)

[0647] B1出苗后功效-测试1

[0648] 将以下多种测试物种的种子播种在盆中的标准土壤中:-龙葵 (*Solanum nigrum*) (SOLNI)、反枝苋 (*Amaranthus retroflexus*) (AMARE)、大狗尾草 (*Setaria faberi*) (SETFA)、稗草 (*Echinochloa crus-galli*) (ECHCG)、碗仔花 (*Ipomoea hederacea*) (IPOHE)、多年生黑麦草 (*Lolium perenne*) (LOLPE)。在温室中在受控条件(在24°C/16°C白天/夜晚下;14小时光照;65%湿度)下培养八天后(出苗后),用水性喷雾溶液喷洒这些植物,所述水性喷雾溶液源自工业级活性成分在丙酮/水(50:50)溶液中的配制品,所述溶液含有0.5%吐温20(聚乙烯脱水山梨糖醇单月桂酸酯,CAS RN9005-64-5)。以1000g/ha施用化合物。然后使测试植物在温室中在受控条件(在24°C/16°C白天/夜晚下;14小时光照;65%湿度)下生长,并且每日浇水两次。在13天之后,对所述测试给植物造成的损害百分比进行评价。以五分制评估生物活性(5=80%-100%;4=60%-79%;3=40-59%;2=20-39%;1=0-19%)。在表中的空白值表明那种化合物未在那种物种上进行测试。

[0649] 表5 出苗后施用后具有式(I)的化合物对杂草物种的控制

化合物	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
[0650] A-1.036	5	5	5	5	5	5

[0651] B2出苗后功效-测试2

[0652] 将以下多种测试物种的种子播种在盆中的标准土壤中:-龙葵 (*Solanum nigrum*) (SOLNI)、反枝苋 (*Amaranthus retroflexus*) (AMARE)、大狗尾草 (*Setaria faberi*) (SETFA)、稗草 (*Echinochloa crus-galli*) (ECHCG)、碗仔花 (*Ipomoea hederacea*) (IPOHE)、多年生黑麦草 (*Lolium perenne*) (LOLPE)。在温室中在受控条件(在24°C/16°C白天/夜晚下;14小时光照;65%湿度)下培养八天后(出苗后),用水性喷雾溶液喷洒这些植物,所述水性喷雾溶

液源自工业级活性成分在丙酮/水 (50:50) 溶液中的配制品,所述溶液含有0.5%吐温20(聚氧乙烯脱水山梨糖醇单月桂酸酯,CAS RN9005-64-5)。以250g/ha施用化合物。然后使测试植物在温室中在受控条件(在24°C/16°C白天/夜晚下;14小时光照;65%湿度)下生长,并且每日浇水两次。在13天之后,对所述测试给植物造成的损害百分比进行评价。以五分制评估生物活性(5=80%-100%;4=60%-79%;3=40-59%;2=20-39%;1=0-19%)。在表中的空白值表明那种化合物未在那种物种上进行测试。

[0653] 表6 出苗后施用后具有式(I)的化合物对杂草物种的控制

化合物	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
<b>A-1.024</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>4</b>	<b>5</b>
<b>A-1.025</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>
<b>A-1.026</b>	<b>4</b>	<b>4</b>	<b>2</b>	<b>1</b>	<b>0</b>	<b>0</b>
<b>A-1.027</b>	<b>5</b>	<b>4</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>4</b>
<b>A-1.028</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>

[0655]

化合物	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A-1.029	4	5	4	4	2	5
A-1.030	4	5	4	5	4	5
A-1.031	5	5	4	4	4	4
A-1.032	5	5	5	5	5	5
A-1.033	5	5	5	5	4	5
A-1.034	5	5	5	5	1	5
A-1.035	4	5	4	4	4	4
A-1.036	5	5	5	5	5	5
A-1.037	1	5	5	1	3	5
A-1.038	5	5	5	5	5	5
A-1.039	5	5	5	5	5	5
A-1.040	3	3	0	0	0	0
A-1.041	5	5	4	1	1	2
A-1.042	5	5	5	5	5	3
A-1.044	5	5	5	4	3	0
A-2.030	3	4	0	1	0	4
A-2.037	1	2	1	1	2	2
A-3.028	4	5	4	5	5	5
A-3.029	4	5	2	2	1	5
A-3.030	5	5	5	4	2	5
A-3.035	5	5	5	5	4	5
A-3.036	5	5	4	4	4	5
A-3.038	5	5	5	5	2	5
A-4.029	4	4	0	1	1	4
A-4.030	2	3	0	1	1	3
A-4.035	1	3	0	0	0	3
A-4.036	2	5	1	3	3	4

化合物	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
<b>A-4.038</b>	<b>1</b>	<b>5</b>	<b>0</b>	<b>1</b>	<b>1</b>	<b>2</b>
<b>A-1.383</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>
<b>A-1.384</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>4</b>	<b>3</b>	<b>5</b>
<b>A-1.385</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>5</b>

[0657] B3出苗后功效-测试3

[0658] 将以下多种测试物种的种子播种在盆中的标准土壤中：-反枝苋 (*Amaranthus retroflexus*) (AMARE)、大狗尾草 (*Setaria faberi*) (SETFA)、稗草 (*Echinochloa crus-galli*) (ECHCG)、碗仔花 (*Ipomoea hederacea*) (IPOHE)、玉蜀黍 (*Zea Mays*) (ZEAMX)、苘麻 (*Abutilon theophrasti*) (ABUTH)。在温室中在受控条件 (在24°C/16°C白天/夜晚下;14小时光照;65%湿度) 下培养八天后 (出苗后), 用水性喷雾溶液喷洒这些植物, 所述水性喷雾溶液源自工业级活性成分在丙酮/水 (50:50) 溶液中的配制品, 所述溶液含有0.5%吐温20 (聚氧乙烯脱水山梨糖醇单月桂酸酯, CAS RN 9005-64-5)。以250g/ha施用化合物。然后使测试植物在温室中在受控条件 (在24°C/16°C白天/夜晚下;14小时光照;65%湿度) 下生长, 并且每日浇水两次。在13天之后, 对所述测试给植物造成的损害百分比进行评价。以五分制评估生物活性 (5=80%-100%;4=60%-79%;3=40-59%;2=20-39%;1=0-19%)。在表中的空白值表明那种化合物未在那种物种上进行测试。

[0659] 表7 出苗后施用后具有式 (I) 的化合物对杂草物种的控制

化合物	AMARE	ZEAMX	SETFA	ABUTH	ECHCG	IPOHE
<b>A-1.380</b>	<b>4</b>	<b>2</b>	<b>3</b>	<b>3</b>	<b>1</b>	<b>3</b>
<b>A-1.381</b>	<b>4</b>	<b>1</b>	<b>2</b>	<b>3</b>	<b>0</b>	<b>4</b>
<b>A-1.382</b>	<b>4</b>	<b>5</b>	<b>4</b>	<b>4</b>	<b>4</b>	<b>5</b>
<b>A-3.386</b>	<b>4</b>	<b>5</b>	<b>4</b>	<b>4</b>	<b>5</b>	<b>4</b>
<b>C-1.013</b>	<b>5</b>	<b>4</b>	<b>4</b>	<b>4</b>	<b>5</b>	<b>4</b>

化合物	AMARE	ZEAMX	SETFA	ABUTH	ECHCG	IPOHE
<b>A-1.386</b>	<b>4</b>	<b>4</b>	<b>4</b>	<b>3</b>	<b>4</b>	<b>4</b>
<b>A-1.387</b>	<b>4</b>	<b>4</b>	<b>4</b>	<b>4</b>	<b>4</b>	<b>4</b>
<b>A-1.388</b>	<b>5</b>	<b>4</b>	<b>4</b>	<b>5</b>	<b>4</b>	<b>4</b>
<b>A-1.389</b>	<b>4</b>	<b>5</b>	<b>5</b>	<b>4</b>	<b>5</b>	<b>5</b>
<b>A-1.390</b>	<b>5</b>	<b>1</b>	<b>5</b>	<b>4</b>		<b>4</b>
<b>A-1.391</b>	<b>4</b>	<b>1</b>	<b>4</b>	<b>2</b>		<b>3</b>
<b>A-1.392</b>	<b>5</b>	<b>2</b>	<b>5</b>	<b>4</b>		<b>3</b>

[0662] B4出苗前功效-测试1

[0663] 将以下多种测试物种的种子播种在盆中的标准土壤中:龙葵 (*Solanum nigrum*) (SOLNI)、反枝苋 (*Amaranthus retroflexus*) (AMARE)、大狗尾草 (*Setaria faberi*) (SETFA)、稗草 (*Echinochloa crus-galli*) (ECHCG)、碗仔花 (*Ipomoea hederacea*) (IPOHE)、多年生黑麦草 (*Lolium perenne*) (LOLPE)。在温室中在受控条件 (在24°C/16°C白天/夜晚下;14小时光照;65%湿度) 下培养一天之后 (出苗前),用水性喷雾溶液喷洒这些植物,所述水性喷雾溶液源自工业级活性成分在丙酮/水 (50:50) 溶液中的配制品,所述溶液含有0.5%吐温20 (聚氧乙烯脱水山梨糖醇单月桂酸酯,CAS RN9005-64-5)。以1000g/ha施用化合物。然后使测试植物在受控制的条件 (在24°C/16°C白天/夜晚下;14小时光照;65%湿度) 下生长于温室中,并且每天浇水两次。在13天之后,对所述测试给植物造成的损害百分比进行评价。以五分制评估生物活性 (5=80%-100%;4=60%-79%;3=40-59%;2=20-39%;1=0-19%)。在表中的空白值表明那种化合物未在那种物种上进行测试。

[0664] 表8 在出苗前施用之后具有式 (I) 的化合物对杂草物种的控制

	化合物	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
[0665]	A-1.036	5	5	5	5	5	5

[0666] B5出苗前功效-测试2

[0667] 将以下多种测试物种的种子播种在盆中的标准土壤中:龙葵 (*Solanum nigrum*) (SOLNI)、反枝苋 (*Amaranthus retroflexus*) (AMARE)、大狗尾草 (*Setaria faberi*) (SETFA)、稗草 (*Echinochloa crus-galli*) (ECHCG)、碗仔花 (*Ipomoea hederacea*) (IPOHE)、多年生黑麦草 (*Lolium perenne*) (LOLPE)。在温室中在受控条件 (在24°C/16°C白天/夜晚下;14小时光照;65%湿度) 下培养一天之后 (出苗前),用水性喷雾溶液喷洒这些植物,所述水性喷雾溶液源自工业级活性成分在丙酮/水 (50:50) 溶液中的配制品,所述溶液含有0.5%吐温20 (聚氧乙烯脱水山梨糖醇单月桂酸酯,CAS RN9005-64-5)。以250g/ha施用化合物。然后使测试植物在受控制的条件 (在24°C/16°C白天/夜晚下;14小时光照;65%湿度) 下生长于温室中,并且每天浇水两次。在13天之后,对所述测试给植物造成的损害百分比进行评价。以五分制评估生物活性 (5=80%-100%;4=60%-79%;3=40-59%;2=20-39%;1=0-19%)。在表中的空白值表明那种化合物未在那种物种上进行测试。

[0668] 表9在出苗前施用之后具有式 (I) 的化合物对杂草物种的控制

[0669]

化合物	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A-1.024	5	5	5	4	2	0
A-1.025	5	5	5	4	5	1
A-1.026	0	0	0	0	0	0
A-1.027	5	4	3	2	1	4
A-1.028	5	5	5	5	4	5
A-1.029	3	5	1	2	5	1
A-1.030	5	5	5	4	5	0
A-1.031	3	2	1	1	2	1
A-1.032	5	5	5	5	5	2
A-1.033	1	1	2	1	0	1
A-1.034	0	2	0	0	0	0
A-1.035	4	3	3	3	1	1
A-1.036	5	5	5	5	5	5

化合物	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A-1.037	1	2	0	0	2	0
A-1.038	5	5	0	5	5	2
A-1.039	5	5	5	4	5	3
A-1.040	0	0	0	0	0	0
A-1.041	4	0	0	0	0	0
A-1.042	5	5	5	1	2	2
A-1.044	5	5	5	2	3	1
A-2.030	0	0	0	0	0	0
A-2.037	0	0	1	1	0	1
A-3.028	5	5	5	5	5	5
A-3.029	4	5	2	2	3	3
A-3.030	5	5	5	4	4	3
A-3.035	4	5	5	5	4	5
A-3.036	5	5	5	5	5	5
A-3.038	5	5	1	5	2	5
A-4.029	2	4	0	0	0	0
A-4.030	3	4	1	2	1	1
A-4.035	0	0	0	1	1	1
A-4.036	2	5	0	1	1	3
A-4.038	2	1	0	0	0	0
A-1.383	5	5	4	3	4	5
A-1.384	2	1	0	0	0	2
A-1.385	5	5	5	5	5	5

[0671] B6出苗前功效-测试3

[0672] 将以下多种测试物种的种子播种在盆中的标准土壤中:反枝苋 (*Amaranthus retroflexus*) (AMARE)、大狗尾草 (*Setaria faberi*) (SETFA)、稗草 (*Echinochloa crus-galli*) (ECHCG)、碗仔花 (*Ipomoea hederacea*) (IPOHE)、玉蜀黍 (*Zea Mays*) (ZEMX)、苘麻 (*Abutilon theophrasti*) (ABUTH)。在温室中在受控条件(在24°C/16°C白天/夜晚下;14小时光照;65%湿度)下培养一天之后(出苗前),用水性喷雾溶液喷洒这些植物,所述水性喷雾溶液源自工业级活性成分在丙酮/水(50:50)溶液中的配制品,所述溶液含有0.5%吐温20(聚氧乙烯脱水山梨糖醇单月桂酸酯,CAS RN 9005-64-5)。以250g/ha施用化合物。然后

使测试植物在受控制的条件下(在24°C/16°C白天/夜晚下;14小时光照;65%湿度)下生长于温室中,并且每天浇水两次。在13天之后,对所述测试给植物造成的损害百分比进行评价。以五分制评估生物活性(5=80%-100%;4=60%-79%;3=40-59%;2=20-39%;1=0-19%)。在表中的空白值表明那种化合物未在那种物种上进行测试。

[0673] 表10 在出苗前施用之后具有式(I)的化合物对杂草物种的控制

化合物	AMARE	ZEAMX	SETFA	ABUTH	ECHCG	IPOHE
A-1.380	5	2	1	4	0	4
A-1.381	3	1	0	1	0	3
A-1.382	5	4	5	4	5	5
A-3.386	5	5	5	5	5	5
C-1.013	5	4	5	5	5	5
[0674] A-1.386	2	2	5	2	5	4
A-1.387	5	4	5	4	5	5
A-1.388	5	4	5	5	5	5
A-1.389	5	4	5	3	5	5
A-1.390	5	1	5	5		5
A-1.391	5	0	5	2		2
A-1.392	5	2	5	5	5	5