

[19] 中华人民共和国国家知识产权局

[51] Int. Cl<sup>7</sup>



# [12] 发明专利说明书

C07C 57/30

C07C 57/58 C07C 59/48

C07C 59/52 C07C 59/64

C07C 69/612 C07C 69/73

C07C205/53 C07C229/34

C07C233/11 C07C235/32

C07C317/44 C07C323/56

[21] ZL 专利号 95192464.8

[43] 授权公告日 2003 年 4 月 16 日

[11] 授权公告号 CN 1105703C

[22] 申请日 1995.4.6 [21] 申请号 95192464.8

[30] 优先权

[32] 1994.4.6 [33] JP [31] 68432/1994

[32] 1994.7.7 [33] JP [31] 155791/1994

[32] 1994.11.4 [33] JP [31] 271198/1994

[32] 1995.1.27 [33] JP [31] 11790/1995

[86] 国际申请 PCT/JP95/00663 1995.4.6

[87] 国际公布 WO95/27693 日 1995.10.19

[85] 进入国家阶段日期 1996.10.7

[71] 专利权人 盐野义制药株式会社

地址 日本大阪府大阪市

[72] 发明人 大塚俊一 村司孝己 铃木慎司

益子道生 竹中秀行

[56] 参考文献

JP 平 1157955 1989.06.21 C07D207/416

JP 昭 62-153283 1987.07.08 C07D401/12

JP 昭 63-139149 1988.06.10 C07C59/66

US3422140 1969.01.14 C07C103/26

审查员 曾武宗

[74] 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司

代理人 邵红 王景朝

C07C327/04 C07C327/22

C07C327/36 C07C327/40

C07D211/14 C07D213/64

C07D215/14 C07D231/14

C07D239/26 C07D239/34

C07D239/38 C07D239/88

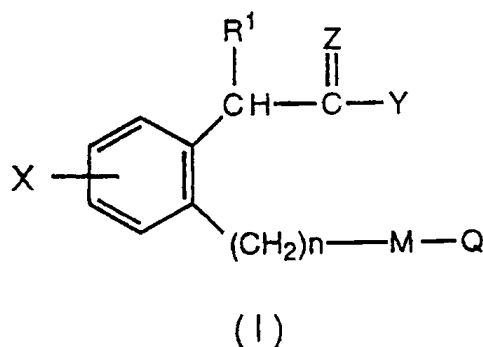
A01N 37/00 A01N 43/00

权利要求书 8 页 说明书 159 页

[54] 发明名称  $\alpha$ -取代苯乙酸衍生物,它的制备及含有该化合物的农用杀菌剂

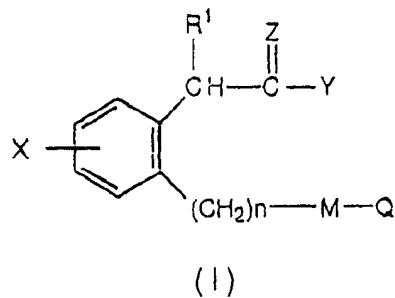
[57] 摘要

由通式(I)表示的,用作农用杀菌剂的  $\alpha$ -取代苯乙酸衍生物或其盐,其制备方法及其制备中的中间体,和含有这类化合物作为活性组分的农用杀菌剂,其中  $R^1$  代表卤素、烷基、OH、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、氨基或硝基; Q 代表芳基、杂环、一或二取代的亚甲氨基、(取代的氨基)甲基、烷基、链烯基、炔基、取代羰基或取代磺酰基; X 代表氢、卤素、烷基或 OH; Y 代表 OH、烷硫基或氨基; Z 代表氧或硫; M 代表氧、S(O)<sub>i</sub>(i 是 0、1 或 2), NR<sup>2</sup> (R<sup>2</sup> 是氢、烷基或酰基) 或单链; n 代表 0、1 或 2。



ISSN 1008-4274

## 1. 下述式 (I) 化合物或其盐:



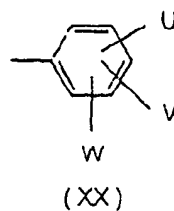
- 5 式中:  $R'$  是卤原子, 被  $C_{1-4}$  烷基任意取代的羟基或被  $C_{1-4}$  烷基任意取代的氨基;  $Q$  是被选自卤原子、甲基、三氟甲基和甲氧基的 1-3 个取代基任意取代的苯基或被选自卤原子、甲基和三氟甲基的 1-3 个取代基任意取代的吡啶基;  $X$  是氢原子;  $Y$  是被  $C_{1-4}$  烷基任意取代的羟基、 $C_{1-4}$  烷硫基或被  $C_{1-4}$  烷基任意取代的氨基, 条件是, 当  $R'$  是羟基时,  $Y$  不是  $C_{1-4}$  烷氧基;  $Z$  是氧原子或硫原子;  $M$  是氧原子或硫原子; 且  $n$  是 0 或 1。

2. 根据权利要求 1 的化合物或其盐, 其中  $R'$  是卤原子、羟基、 $C_{1-4}$  烷氧基或被  $C_{1-4}$  烷基任意取代的氨基。

3. 根据权利要求 1 的化合物或其盐, 其中  $R'$  是  $C_{1-4}$  烷基。

15 4. 根据权利要求 1 的化合物或其盐, 其中  $R'$  是甲氧基。

5. 根据权利要求 1 的化合物或其盐, 其中  $Q$  是下式 (XX) 的基团:



20 其中  $U$ ,  $V$  和  $W$  相同或不同, 是氢原子、卤原子、被至少一个卤原子任意取代的  $C_{1-4}$  烷基或被  $C_{1-4}$  烷基任意取代的羟基。

6. 根据权利要求 5 的化合物或其盐, 其中  $U$ 、 $V$  和  $W$  相同或不同, 是氢原子、氟原子、甲基、三氟甲基或甲氧基。

7. 根据权利要求 1 的化合物或其盐, 其中  $Q$  是被选自卤原子、甲

基和三氟甲基的1-3个取代基任意取代的吡啶基。

8. 根据权利要求1的化合物或其盐,其中X是氢原子。
9. 根据权利要求1的化合物或其盐,其中Y是C<sub>1-4</sub>烷氧基。
10. 根据权利要求1的化合物或其盐,其中的Y是甲氧基。
- 5 11. 根据权利要求1的化合物或其盐,其中Y是单C<sub>1-4</sub>烷基氨基。
12. 根据权利要求1的化合物或其盐,其中Y是单甲基氨基。
13. 根据权利要求1的化合物或其盐,其中Z是氧原子。
14. 根据权利要求1的化合物或其盐,其中M是氧原子或硫原子。
15. 根据权利要求1的化合物或其盐,其中n是0。
- 10 16. 根据权利要求1的化合物或其盐,其中n是1。
17. 根据权利要求1的化合物或其盐,其中X是氢原子,R<sup>1</sup>是羟基,Z是氧原子,Y是被C<sub>1-4</sub>烷基任意取代的氨基;M是氧原子,Q是被选自卤原子、甲基、三氟甲基和甲氧基的1-3个取代基任意取代的苯基,且n是0或1。
- 15 18. 根据权利要求1的化合物或其盐,其中X是氢原子,R<sup>1</sup>是C<sub>1-4</sub>烷氧基,Z是氧原子,Y是C<sub>1-4</sub>烷氧基或被C<sub>1-4</sub>烷基任意取代的氨基;M是氧原子,Q是被选自卤原子、甲基、三氟甲基和甲氧基的1-3个取代基任意取代的苯基,且n是0或1。
19. 根据权利要求1的化合物或其盐,其中X是氢原子,R<sup>1</sup>是羟基,Z是氧原子,Y是被C<sub>1-4</sub>烷基任意取代的氨基;M是氧原子,Q是被选自卤原子、甲基和三氟甲基的1-3个取代基任意取代的吡啶基,且n是0或1。
- 20 20. 根据权利要求1的化合物或其盐,其中X是氢原子,R<sup>1</sup>是C<sub>1-4</sub>烷氧基,Z是氧原子,Y是C<sub>1-4</sub>烷氧基或被C<sub>1-4</sub>烷基任意取代的氨基;M是氧原子,Q是被选自卤原子、甲基和三氟甲基的1-3个取代基任意取代的吡啶基,且n是0或1。
- 25 21. 根据权利要求1的化合物或其盐,其中,  
X是氢原子,R<sup>1</sup>是羟基,Z是氧原子,Y是一甲基氨基,M是氧原子,Q是苯基,以及n是0(化合物序号1);
- 30 X是氢原子,R<sup>1</sup>是羟基,Z是氧原子,Y是氨基,M是氧原子,Q是苯基,以及n是0(化合物序号2);
- X是氢原子,R<sup>1</sup>是羟基,Z是氧原子,Y是一甲基氨基,M是氧原

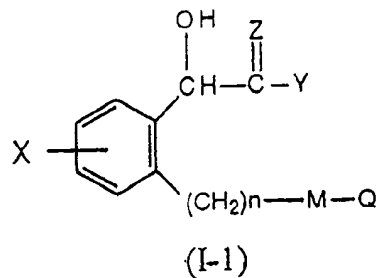
- 子, Q 是 3,4-二甲基苯基, 以及 n 是 0 (化合物序号 15);  
X 是氢原子, R' 是羟基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 3,5-二甲基苯基, 以及 n 是 0 (化合物序号 16);  
X 是氢原子, R' 是羟基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 2-甲基苯基, 以及 n 是 1 (化合物序号 64);  
X 是氢原子, R' 是羟基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 2,5-二甲基苯基, 且 n 是 1 (化合物序号 75);  
X 是氢原子, R' 是羟基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 4-氯-2-甲苯基, 且 n 是 1 (化合物序号 113);  
X 是氢原子, R' 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是甲氧基, M 是氧原子, Q 是 2,5-二甲苯基, 且 n 是 1 (化合物序号 139);  
X 是氢原子, R' 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 2,5-二甲苯基, 且 n 是 1 (化合物序号 140);  
X 是氢原子, R' 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 4-氯-2-甲苯基, 且 n 是 1 (化合物序号 186);  
X 是氢原子, R' 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 2-甲苯基, 且 n 是 1 (化合物序号 197);  
X 是氢原子, R' 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 3-氯-5-三氟甲基吡啶-2-基, 且 n 是 1 (化合物序号 427);  
X 是氢原子, R' 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 3,5-二氯吡啶-2-基, 且 n 是 1 (化合物序号 433);  
X 是氢原子, R' 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 3-三氟甲基-5-氯吡啶-2-基, 且 n 是 1 (化合物序号 448);  
X 是氢原子, R' 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 3-氯吡啶-2-基, 且 n 是 1 (化合物序号 466);  
X 是氢原子, R' 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是  $\alpha$ -甲基-4-氯亚苄氨基, 且 n 是 1 (化合物序号 474);  
X 是氢原子, R' 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是  $\alpha$ -甲基-4-甲氧基亚苄氨基, 且 n 是 1 (化合物序号 492);

X 是氢原子, R' 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 4,  $\alpha$ -二甲基亚苄氨基, 且 n 是 1 (化合物序号 498);

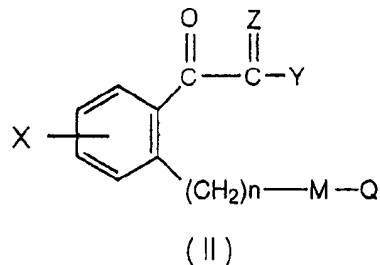
或 X 是氢原子, R' 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是  $\alpha$ -甲基-4-三氟甲基亚苄氨基, 且 n 是 1 (化合物序号 526)。

22. 含有权利要求 1 的化合物为活性组分的农用杀菌组合物。

23. 下述式 (I-1) 化合物的制备方法:

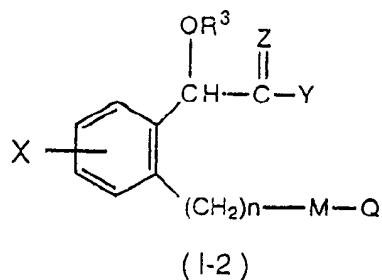


10 其中每个符号均同权利要求 1 中定义, 该方法包括还原下述式 (II) 化合物:

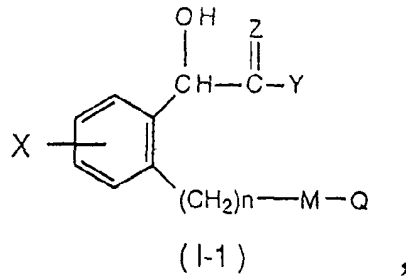


其中每个符号均同权利要求 1 中定义。

15 24. 下述式 (I-2) 化合物的制备方法:



其中  $R^3$  是  $C_{1-4}$  烷基，其它符号的定义同权利要求 1，该方法包括：使下述式 (I-1) 化合物



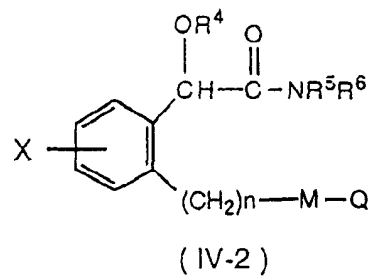
- 5 其中的每个符号定义均与权利要求 1 相同，  
与下述式 (XXII) 化合物反应：



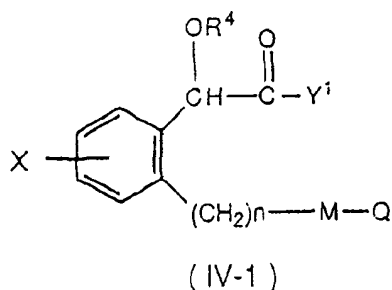
其中 L 是离去基团，其它符号定义同上。

25. 下述式 (IV-2) 化合物的制备方法：

10



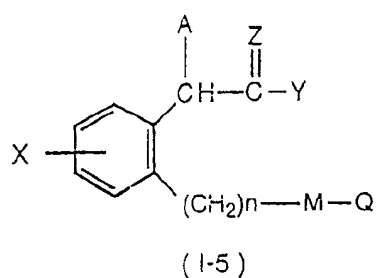
其中  $R^4$  是  $C_{1-4}$  烷基， $R^5$  是氢原子或  $C_{1-4}$  烷基， $R^6$  是氢原子或  $C_{1-4}$  烷基，其它符号定义同权利要求 1 中的定义，该方法包括使下述式 (IV-1) 化合物与胺反应，



15

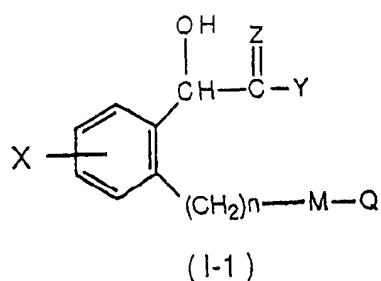
其中  $Y^1$  是  $C_{1-4}$  烷氧基或  $C_{1-4}$  烷硫基，其它符号定义同上。

26. 下述式 (I-5) 化合物的制备方法：



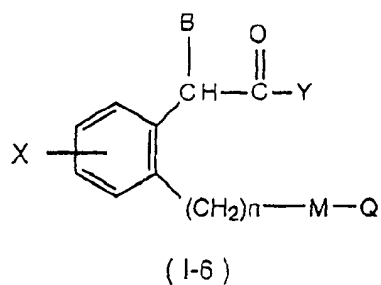
其中 A 是卤原子，其它符号定义均与权利要求 1 中相同，该方法包括卤代下述式 (I-1) 化合物

5



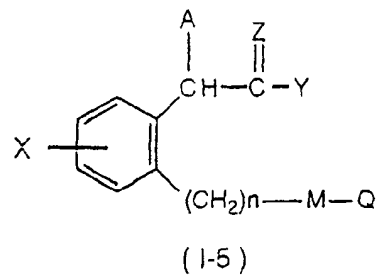
其中每个符号定义均与权利要求 1 中相同。

27. 下述式 (I-6) 化合物的制备方法:



10

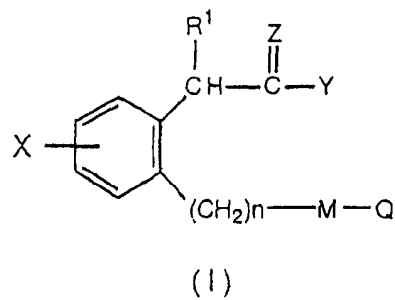
其中 B 是 C<sub>1-4</sub> 烷氧基或被 C<sub>1-4</sub> 烷基任意取代的氨基，其它符号定义均与权利要求 1 中相同，该方法包括使下式 (I-5) 化合物与醇的金属盐、烷基硫醇的金属盐、氨、胺或亚硝酸盐反应，



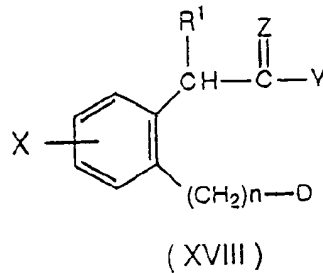
其中 A 是卤原子，其它符号定义与权利要求 1 中相同。

28. 下述式 (I) 化合物的制备方法：

5



其中每个符号定义均与权利要求 1 中相同，该方法包括使下述式 (XVIII) 化合物



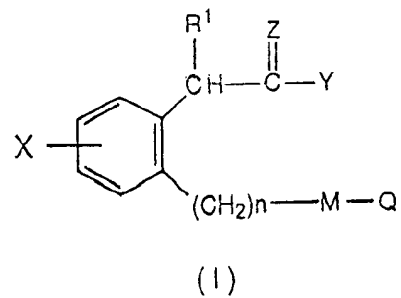
10

其中 D 是卤原子，其它符号定义均与权利要求 1 中相同，与下述式 (XIX) 化合物反应



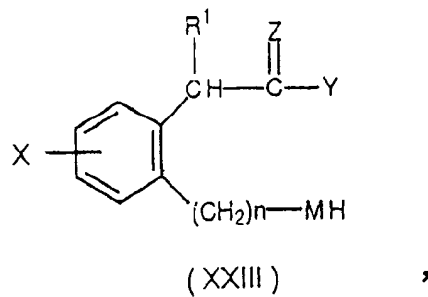
其中每个符号定义均与权利要求 1 中相同。

15 29. 下述式 (I) 化合物的制备方法，



其中每个符号的定义均与权利要求 1 中相同；该方法包括使下述式 (XXIII) 化合物

5



其中每个符号定义均与权利要求 1 中相同，  
与下式 (XXIV) 化合物反应，



10 其中 L 是离去基团，Q 的定义与权利要求 1 中相同。

30. 一种控制植物病原体真菌的方法，该方法包括：将权利要求 1 的化合物或其盐作为活性组份，施至植物病原体真菌繁殖或将要繁殖的场所。

31. 权利要求 1 的化合物或其盐在农用杀菌剂的生产中的用途。

$\alpha$  - 取代苯乙酸衍生物, 它的制备及  
含有该化合物的农用杀菌剂

5        技术领域

本发明涉及新的  $\alpha$  - 取代苯乙酸衍生物, 它的制备方法, 以及含有该化合物作为活性组分的农用杀菌剂。

发明背景

10        日本专利 JP - A 60 - 54949 和德国专利 DE2742065 已经公开了若干种  $\alpha$  - 取代苯乙酸酯衍生物。但是这些化合物均是在苯基的 3 - 位带有取代基, 而未公开在 2 - 位带有取代基的化合物。日本专利 JP - A 3 - 17052 和 JP - A 3 - 157350 也公开了  $\alpha$  - 取代苯乙酸酯衍生物。然而他们只公开了 2 - 羟基 - 2 - 苯乙酸或它的乙酸酯作为中间体或杀虫剂, 但从未提及它的杀菌活性。

15        JP - A 4 - 288045, JP - A 4 - 261147, WO 93/15046, EP - A - 498396, JP - A 3 - 169842, EP - A - 532022, JP - A 7 - 17930 和 EP - A - 619301 也公开了相近的化合物。

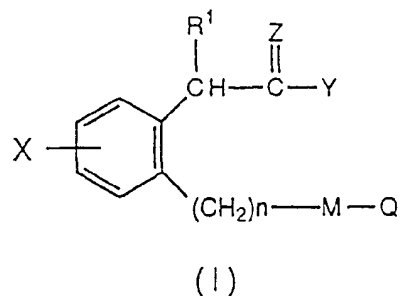
本发明提供的是一种具有强杀菌活性的新化合物, 它的制备方法, 以及含有该化合物作为活性组份的农用杀菌剂。

20        发明公开内容

在这种情况下, 本发明的发明人为了获得具有强杀菌活性的化合物, 进行了深入细致的研究。结果发现, 在苯基的 2 - 位带有取代基的  $\alpha$  - 取代苯乙酸衍生物具有强的杀菌活性, 从而使本发明得以完成。

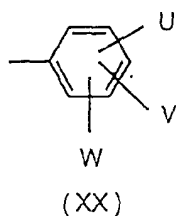
本发明提供了:

25        1. 下述式(I)化合物或其盐:



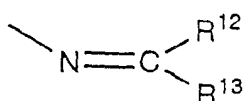
- 式中： $R^1$ 是卤原子，被任意取代的烷基、被任意取代的羟基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、被任意取代的氨基或硝基； $Q$ 是被任意取代的芳基、任意取代的杂环基、一或二取代的亚甲基氨基、任意取代的(取代的亚氨基)甲基、任意取代的烷基、任意取代的链烯基、任意取代的炔基、取代的羰基或取代的磺酰基； $X$ 是氢原子、卤原子、被任意取代的烷基或任意取代的羟基； $Y$ 是被任意取代的羟基、烷硫基或任意取代的氨基，条件是，当 $R^1$ 是羟基、 $Y$ 不是烷氧基； $Z$ 是氧原子或硫原子； $M$ 是氧原子， $S(O)_i$ (其中 $i$ 是0, 1或2)， $NR^2$ (其中 $R^2$ 是氢原子、烷基或酰基)或一个单键；且 $n$ 是0, 1或2；
10. 2.根据上述条款1的化合物或其盐，其中 $R^1$ 是卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基烷基、羟基、烷氧基、链烯氧基、炔氧基、卤代烷氧基、卤代链烯氧基、卤代炔氧基、烷氧基烷氧基、烷基羰氧基、(烷硫基)羰氧基、烷基磺酰氧基、芳基磺酰氧基、一或二烷基取代的氨基甲酰氧基、芳氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、被烷基任意取代的氨基、硝基或四氢吡喃氧基；
15. 3.根据上述条款1的化合物或其盐，其中 $R^1$ 是烷氧基；  
4.根据上述条款1的化合物或其盐，其中 $R^1$ 是甲氧基；  
5.根据上述条款1的化合物或其盐，其中 $Q$ 是下式(XX)基团；

20



25. 其中 $U, V$ 和 $W$ 相同或不同，是氢原子、卤原子、任意取代的烷基、任意取代的羟基、烷硫基或任意取代的氨基；
- 6.根据上述条款5的化合物或其盐，其中 $U, V$ 和 $W$ 相同或不同，是氢、氯原子、甲基、三氟甲基或甲氧基；
- 7.根据上述条款1的化合物或其盐，其中 $Q$ 是吡啶基、嘧啶基、喹啉基、喹唑啉基、苯并噻唑基或吡唑基，它们中的每一个均可被取代；
30. 8.根据上述条款1的化合物或其盐，其中的 $Q$ 是被任意取代的吡啶基；

9.根据上述条款1的化合物或其盐,其中Q是下式(a)基团:



5

(a)

其中 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 相同或不同,是氢原子、被任意取代的烷基、酰基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、任意取代的氨基、环烷基、任意取代的芳基或被任意取代的杂环基、或者 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 连接形成一个单环或多

10

10.根据上述条款9的化合物或其盐,其中 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 相同或不同,是氢原子、烷基、卤代烷基、烷氧基烷基、烷羰基、任意取代的苯基、任意取代的萘基或任意取代的杂环基,或者 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 连接形成一个环戊烷环或环己烷环,其中每个环均可与另一个环形成稠环;

15

11.根据上述条款9的化合物或其盐,其中 $R^{12}$ 是烷基;

12.根据上述条款9的化合物或其盐,其中 $R^{12}$ 是甲基或乙基;

13.根据上述条款9的化合物或其盐,其中 $R^{13}$ 是被选自下述其团中的1至3个取代基任意取代的苯基,所述基团包括:卤原子、任意取代的烷基、任意取代的羟基、烷硫基、任意取代的氨基、硝基、苯基和氟基;

20

14.根据上述条款9的化合物或其盐,其中 $R^{13}$ 是被选自氯原子、甲基、三氟甲基和甲氧基的1至3个取代基任意取代的苯基;

根据上述条款9的化合物或其盐,其中 $R^{13}$ 是吡啶基、哒嗪基、吡唑基、咪唑基、呋喃基、噻吩基、噁唑基、异噁唑基、苯并噻唑基、喹啉基、喹唑啉基、吡嗪基、吗啉代或哌嗪基,其中的每个基团均可被取代;

25

16.根据上述条款1的化合物或其盐,其中X是氢原子;

17.根据上述条款1的化合物或其盐,其中Y是烷氧基;

18.根据上述条款1的化合物或其盐,其中的Y是甲氧基;

19.根据上述条款1的化合物或其盐,其中Y是一烷基氨基;

30

20.根据上述条款1的化合物或其盐,其中Y是一甲基氨基;

21.根据上述条款1的化合物或其盐,其中Z是氧原子;

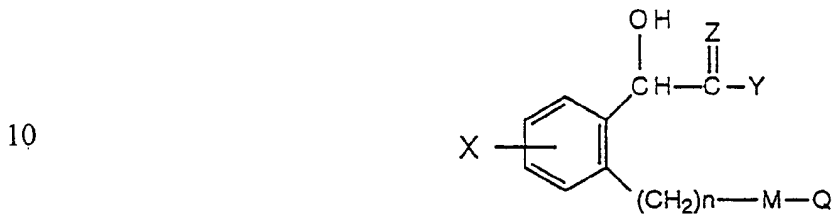
22. 根据上述条款 1 的化合物或其盐, 其中 M 是氧原子, 硫原子或  
是被任意取代的氨基;

23. 根据上述条款 1 的化合物或其盐, 其中 n 是 0;

24. 根据上述条款 1 的化合物或其盐, 其中 n 是 1;

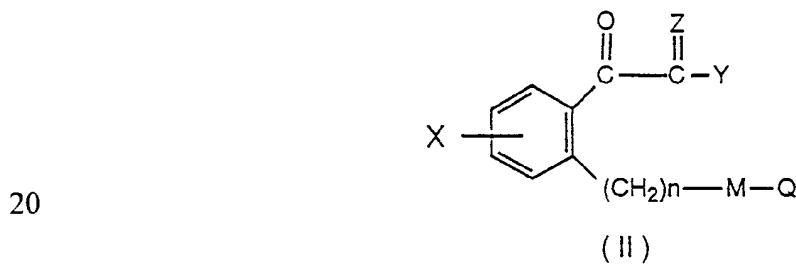
5 25. 含有根据上述条款 1 的化合物为活性组分的农用杀菌组合物;

26. 下述式 ( I - 1 ) 化合物的制备方法:



( I - 1 )

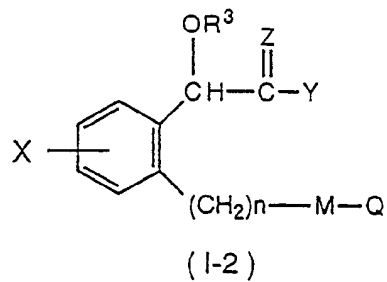
15 其中每个符号均同上述条款 1 中定义, 该方法包括还原下述式 ( II ) 化合物:



其中每个符号均同上述 1 中定义;

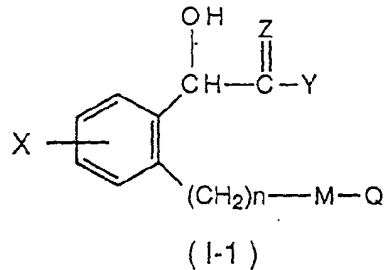
27. 下述式 ( I - 2 ) 化合物的制备方法:

25



其中  $R^3$  是烷基、链烯基、炔基、卤化烷基、烷氧基烷基、烷羰基、(烷硫基)羰基、烷基磺酰基、芳磺酰基、或者是一或二-烷基取代的氨基甲酰基, 其它符号定义同上述条款 1, 该方法包括: 使下述式 (I-1) 化合物

5



10

(其中的每个符号定义均与上述条款 1 相同)  
与下述式 (XXII) 化合物反应:

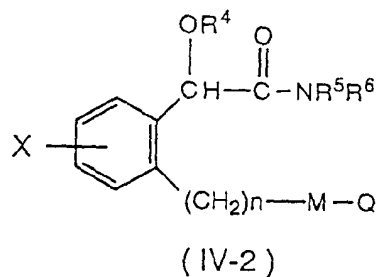
15



其中 L 是离去基团, 其它符号定义同上;

28. 下述式 (IV-2) 化合物的制备方法:

20

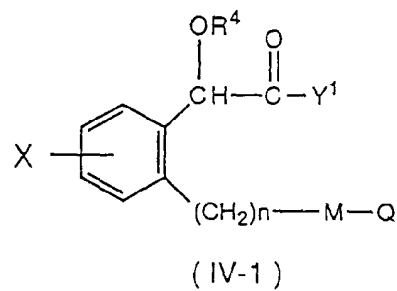


25

其中  $R^4$  是烷基、链烯基、炔基、卤代烷基或烷氧基烷基,  $R^5$  是氢原子或烷基,  $R^6$  是氢原子、烷基或羟烷基, 其它符号定义同上述条款 1 中的定义, 该方法包括使下述式 (IV-1) 化合物与胺反应,

30

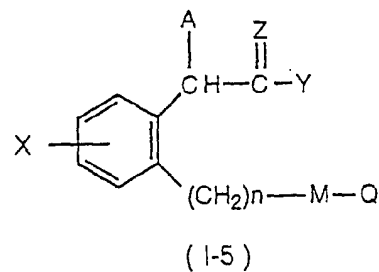
5



其中  $\text{Y}^1$  是烷氧基或烷硫基，其它符号定义同上；

29. 下述式 (I-5) 化合物的制备方法：

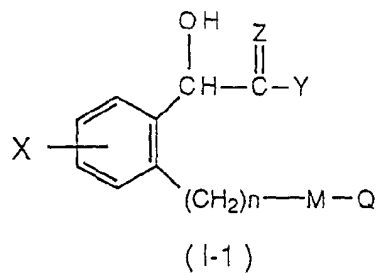
10



15

其中 A 是卤原子，其它符号定义均与上述条款 1 中相同，该方法包括卤代下述式 (I-1) 化合物

20

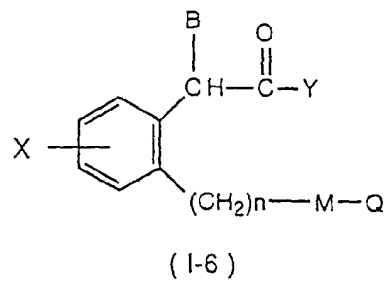


25

其中每个符号定义均与上述条款 1 相同；

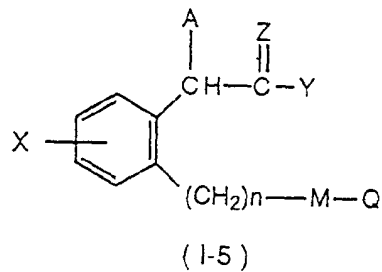
30. 下述式 (I-6) 化合物的制备方法：

30



其中 B 是烷氧基、链烯氧基、炔氧基、卤代烷氧基、烷氧基烷氧基、烷硫基、被烷基任意取代的氨基，或硝基，其它符号定义均与上述条款 1 中相同，该方法包括使下式 (I-5) 化合物与亲核试剂反应，

10

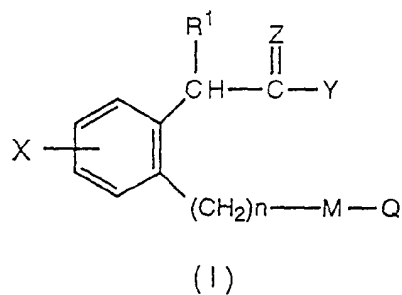


15

其中 A 是卤原子，其它符号定义与上述条款 1 中相同；

31. 下述式 (I) 化合物的制备方法：

20

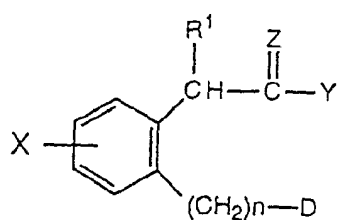


25

其中每个符号定义均与上述条款 1 相同，该方法包括使下述式(XVIII)化合物

30

5



(XVIII)

(其中D是卤原子, 其它符号定义均与上述条款1中相同)  
与下述式(XIX)化合物反应

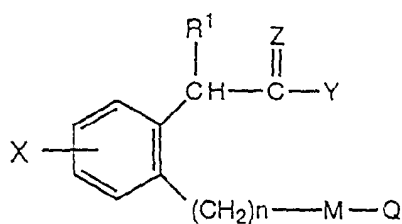
10



其中每个符号定义均与上述条款1中相同;

32. 下述式(I)化合物的制备方法,

15

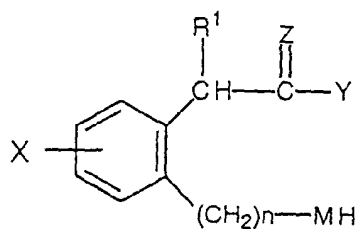


(I)

20

其中每个符号的定义均与上述条款1中相同; 该方法包括使下述式(XXIII)  
化合物

25



(XXIII)

30

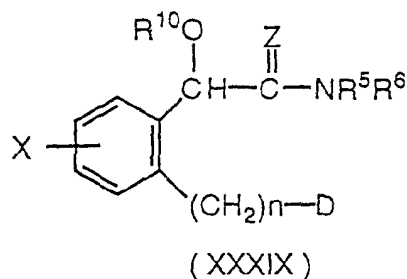
(其中每个符号定义均与上述条款1中相同)  
与下式(XXIV)化合物反应,

## Q - L (XXIV)

其中 L 是离去基团, Q 的定义与上述条款 1 中相同,

33. 下述式(XXXIX)化合物或其盐,

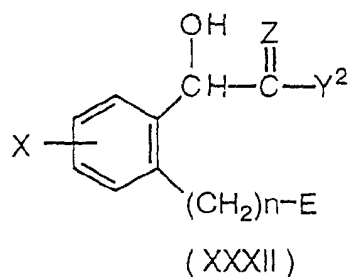
5



10

其中  $R^5$  是氢原子或烷基,  $R^6$  是氢原子、烷基或羟烷基,  $R^{10}$  是任意取代的烷基、任意取代的链烯基或任意取代的炔基, D 是卤原子, 其它符号定义与上述条款 1 中相同;

15 34. 下述式(XXXII)化合物或其盐,



20

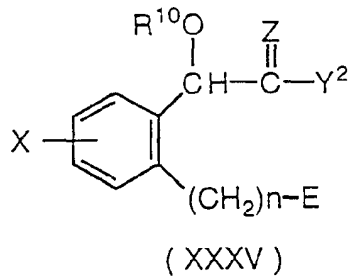
其中  $Y^2$  是烷氧基, E 是被保护的羟基, 其它符号的定义与上述条款 1 中相同;

25 35. 根据上述条款 34 的化合物或其盐, 其中 E 是四氢吡喃基氧基或 1 - 乙氧基乙氧基;

36. 下述式(XXXV)化合物或其盐,

30

5



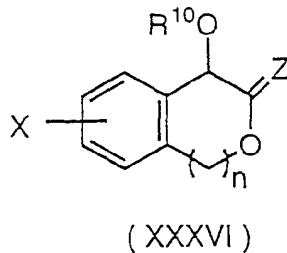
其中  $R^{10}$  是被任意取代的烷基、任意取代的链烯基或任意取代的炔基， $Y^2$  是烷氧基，E 是被保护的羟基，其它符号的定义同于上述条款 1；

10

37. 根据上述条款 36 的化合物或其盐，其中 E 是四氢吡喃基氧基或 1-乙氧基乙氧基；

38. 下述式(XXXVI)化合物或其盐，

15

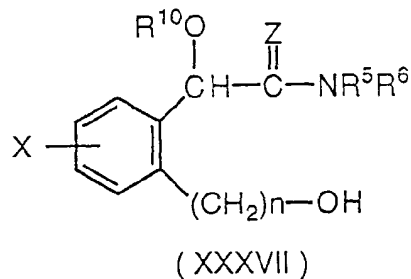


20

其中  $R^{10}$  是被任意取代的烷基、任意取代的链烯基或任意取代的炔基，其它符号的定义同于上述条款 1；

39. 下述式(XXXVII)化合物或其盐，

25



30

其中  $R^5$  是氢原子或烷基， $R^6$  是氢原子、烷基或羟烷基， $R^{10}$  是被任意取代的烷基、任意取代的链烯基或任意取代的炔基，其它符号的定义均与上述条款 1 中相同；和

40. 根据上述条款 33 - 39 中任一条款的化合物或其盐, 其中 Z 是氧原子。

$R^1$  表示的卤原子包括氟、氯、溴和碘。

$R^1$  表示的任意取代的烷基包括, 例如带有 1 至 8 个, 优选 1 至 4 个碳原子的烷基, 例如甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、叔丁基、戊基、己基等。甲基和乙基尤为优选。取代烷基包括, 例如带有至少一个卤原子(如氟、氯、溴、碘, 优选氟)取代基的卤代烷基(如: 二氟甲基、三氟甲基、氯甲基、2-溴乙基、2,3-二氯丙基等); 以含有 1 至 8 个, 优选 1 至 4 个碳原子的烷氧基(如: 甲氧基、乙氧基、丙氧基、丁氧基等)为取代基的烷氧基烷基(如: 甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基等)等。就卤代烷基而言, 三氟甲基尤为优选; 就烷氧基烷基而言, 甲氧基甲基是优选的。

$R^1$  表示的任意取代的羟基包括: 例如, 羟基、任意取代的烷氧基、任意取代的链烯氧基、任意取代的炔氧基、烷羰氧基、(烷硫基)羰氧基、烷基磺酰氧基、芳基磺酰氧基、一或二取代的氨基甲酰氧基、芳氧基、四氢吡喃氧基等。

任意取代的烷氧基的实例包括: 带有 1 至 8 个碳原子、优选 1 至 4 个碳原子的烷氧基, 例如甲氧基、乙氧基、丙氧基、异丙氧基、丁氧基、异丁氧基、叔丁氧基、戊氧基、己氧基等; 带有至少一个卤原子(如: 氟、氯、溴、碘, 优选氟)作为取代基的卤代烷氧基, 例如: 二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯甲氧基等; 以含有 1 至 8 个, 优选 1 至 4 个碳原子的烷氧基(例如甲氧基、乙氧基、丙氧基、丁氧基等)作为取代基的烷氧基烷氧基, 如: 甲氧基甲氧基、2-甲氧基乙氧基、乙氧基甲氧基等)。对于烷氧基而言, 甲氧基、乙氧基和丁氧基, 尤其是甲氧基是优选的。二氟甲氧基是优选的卤代烷氧基。甲氧基甲氧基是优选的烷氧基烷氧基。

被任意取代的链烯氧基的实例包括: 带有 2 至 8 个碳原子, 优选 2 至 4 个碳原子的链烯氧基, 例如乙烯氧基、烯丙氧基、丙烯基氧基、异丙烯基氧基、丁烯氧基、异丁烯基氧基、戊烯氧基、己烯氧基、己二烯氧基等; 带有至少一个卤原子(如氟、氯、溴、碘)为取代基的卤代链烯氧基, 例如 3,3-二氯-2-丙烯基氧基、4,4,4-三氟甲基-2-丁

烯氧基等。烯丙氧基尤为优选。

任意取代的炔氧基的实例包括：含有2至8个，优选2至4个碳原子的炔氧基，例如：乙炔氧基、炔丙基氧基、丁炔基氧基等；带有至少一个卤原子（例如氟、氯、溴、碘）为取代基的卤代炔氧基，例如：3-氯-2-丙炔基氧基、4,4,4-三氟甲基-2-丁炔基氧基等。炔丙基氧基尤为优选。

烷羰氧基的实例包括：带有含1至8个碳原子，优选1至4个碳原子的烷基的烷羰氧基，例如乙酰基氧基、丙酰基氧基、丁酰基氧基等。乙酰基氧基尤为优选。

10 (烷硫基)羰氧基的实例包括：带有含1至8个，优选1至4个碳原子的烷基的(烷硫基)羰氧基，例如(甲硫基)羰氧基、(乙硫基)羰氧基、(丙硫基)羰氧基等。(甲硫基)羰氧基最为优选。

15 烷基磺酰氧基的实例包括：带有含1至8个，优选1-4个碳原子烷基的烷基磺酰氧基，例如：甲磺酰氧基、乙磺酰氧基、丙磺酰氧基等。甲磺酰氧基尤为优选。

芳基磺酰氧基的实例包括：带有含6至12，优选6至8个碳原子的芳基磺酰氧基，例如：苯磺酰氧基、对-甲苯磺酰氧基等。对-甲苯磺酰氧基最为优选。

20 一或二-烷基取代的氨基甲酰氧基的实例包括：带有含1至8个，优选1-4个碳原子的烷基的一或二烷基取代氨基甲酰氧基，例如：N-一甲基氨基甲酰氧基等。N,N-二甲基氨基甲酰氧基，N-一乙基氨基甲酰氧基等。N,N-二甲基氨基甲酰氧基尤为优选。

芳氧基的实例包括：带有6至12，优选6至8个碳原子的芳氧基，例如：苯氧基、2-甲基苯氧基、2,5-二甲基苯氧基等。

25 四氢吡喃氧基的实例包括：2-四氢吡喃氧基等。

$R^1$ 表示的烷硫基包括：例如，含有1至8个，优选1至4个碳原子的烷硫基，如甲硫基、乙硫基、丙硫基和丁硫基。甲硫基尤为优选。

30  $R^1$ 表示的烷基亚磺酰基包括：例如，含有1至8个，优选1至4个碳原子的烷基亚磺酰基，如：甲基亚磺酰基，乙基亚磺酰基，丙基亚磺酰基等。甲基亚磺酰基最为优选。

$R^1$ 表示的烷基磺酰基包括：例如，含有1至8个，优选1至4个碳

原子的烷基磺酰基, 例如: 甲磺酰基、乙磺酰基、丙磺酰基等。甲磺酰基尤为优选。

$R^1$  表示的任意取代的氨基包括: 例如, 氨基, 被含有 1 至 8 个, 优选 1 至 4 个碳原子的烷基一或二-取代的氨基(如: 一甲基氨基、二甲基氨基, 一乙基氨基等), 被甲酰基-取代的氨基、被含有 2 至 8 个, 优选 2 至 4 个碳原子的烷羰基-取代的氨基(如: 甲羰基氨基等)等。被含有 1 至 4 个碳原子的烷基取代的氨基是优选的。一甲基氨基尤为优选。

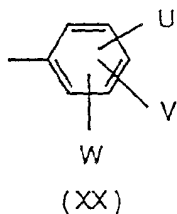
优选的  $R^1$  是卤原子、烷基、卤代烷基、烷氧基烷基、羟基、烷氧基、链烯氧基、炔氧基、卤代烷氧基、卤代链烯氧基、卤代炔氧基、烷氧基烷氧基、烷基羰氧基、(烷硫基)羰氧基、烷基磺酰氧基、芳基磺酰氧基、一或二-烷基取代的氨基甲酰基、芳氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、被烷基任意取代的氨基、硝基, 或四氢吡喃氧基。烷氧基和羟基较为优选。甲氧基最为优选。

$Q$  表示的任意取代的芳基包括: 例如, 含有 6 至 14 个碳原子的芳基, 如: 苯基、萘基等。当芳基被取代时, 取代基选自低级烷基(此处“低级”指  $C_{1-8}$ , 优选  $C_{1-6}$ , 更优选  $C_{1-4}$ ; “低级”在下文所述取代基中具有与此相同的含义)(如: 甲基、乙基、丙基、丁基等), 低级链烯基(如: 乙烯基、烯丙基、丁烯基等), 低级炔基(如: 乙炔基、炔丙基、丁炔基等), 环烷基(如: 环丙基、环戊基、环己基等), 低级烷氧基低级烷基(如: 甲氧基甲基、乙氧基甲基、2-甲氧基乙基等)环烯基(如: 环戊烯基、环己烯基等), 低级链烷酰基(如: 乙酰基、丙酰基、异丁酰基等)低级烷基甲硅烷基、(如: 三甲基甲硅烷基、三乙基甲硅烷基、三丙基甲硅烷基、三丁基甲硅烷基等), 卤代(低级)烷基(如: 二氟甲基、三氟甲基、氯甲基、2-溴乙基、2,3-二氯丙基等), 二(低级)烷基氨基(如: 二甲基氨基、二乙基氨基等), 苯基、苯基(低级)烷基(如: 苄基、苯乙基等), 苯基(低级)链烯基(如: 苯乙烯基、肉桂基等), 咪喃基(低级)烷基(如: 3-咪喃基甲基、2-咪喃基乙基等), 咪喃基(低级)链烯基(如: 3-咪喃基乙烯基、2-咪喃基烯丙基等), 卤原子(如: 氟、氯、溴、碘), 硝基、氰基、低级烷硫基(如: 甲硫基、乙硫基、丙硫基等), 低级烷氧羰基(如: 甲氧羰基、乙氧羰基、丙氧羰基等), 甲酰基、氨基、一(低级)烷基氨基(如: 甲氨基、乙氨基等), -OR[此处 R 是氢原子, 低级烷基(如: 甲基、乙基、丙基、丁基等), 低级链

烯基（如乙烯基、烯丙基、丁烯基等），低级炔基（如乙炔基、2-丙炔基、3-丁炔基等），卤代（低级）烷基（如：二氟甲基、三氟甲基、氯甲基、2-溴乙基、2,3-二氯丙基等），低级链烷酰基（如：乙酰基、丙酰基、丁酰基等），苯基，低级烷氧基苯基（如：3-甲氧基苯基、4-乙氧基苯基等），硝基苯基（如：3-硝基苯基、4-硝基苯基等），苯基（低级）烷基（如：苄基、苯乙基、苯丙基等），氟基苯基（低级）烷基（如：3-氟基苯甲基、4-氟基苯乙基等），苯甲酰基，四氢吡喃基，吡啶基，三氟甲基吡啶基、嘧啶基、苯并噻唑基、喹啉基、苯甲酰基（低级）烷基（如：苯甲酰甲基、苯甲酰乙基等），苯磺酰基或低级烷基苯磺酰基（如：甲苯磺酰基等）， $-\text{CH}_2-\text{G}-\text{R}'$  [此处 G 是  $-\text{O}-$ 、 $-\text{S}-$  或  $-\text{NR}''-$ （其中  $\text{R}''$  是氢原子或低级烷基）， $\text{R}'$  是苯基、卤代苯基（如：2-氯苯基、4-氯苯基等），低级烷氧基苯基（如：2-甲氧基苯基、4-乙氧基苯基等），吡啶基或嘧啶基]，等。

取代基可在环上任何可能的位置上。取代基的数目是 1 至 5，优选 1 至 4，更优选 1 至 3，取代基可以相同或不同。

优选的 Q 表示的任意取代芳基由下式 (XX) 表示：



其中 U、V 和 W 可以相同或不同，是氢原子、卤原子、任意取代的烷基、任意取代的羟基、烷硫基、或任意取代的氨基。

U、V 和 W 表示的卤原子包括：例如，氟、氯、溴和碘。氟尤为优选。

U、V 和 W 表示的任意取代的烷基包括：例如， $\text{R}^1$  表示的上述任意取代的烷基。优选的任意取代的烷基是烷基、卤代烷基或烷氧基烷基、甲基、乙基或三氟甲基较为优选，最为优选甲基。

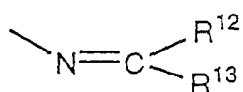
U、V 和 W 表示的任意取代的羟基包括：例如， $\text{R}^1$  表示的上述任意取代的羟基。优选的任意取代的羟基是烷氧基、链烯氧基、炔氧基、卤代烷氧基或苯氧基，烷氧基是较为优选的，最为优选的是甲氧基。

U. V 和 W 表示的烷硫基和任意取代的氨基包括  $R^1$  分别代表的上述烷硫基和任意取代的氨基，甲硫基和二甲基氨基分别是最为优选的。

Q 表示的任意取代的杂环基是；例如，以含有 1 - 4 个选自氮、氧和硫的杂原子为成环原子的 5 至 7 元杂环基。该杂环基可与其它杂环或苯环形成稠环。这些杂环的实例包括吡啶基（如：吡啶 - 2 - 基，吡啶 - 3 - 基等），嘧啶基（如：嘧啶 - 4 - 基、嘧啶 - 2 - 基），喹啉基（如：喹啉 - 4 - 基），喹唑啉基（如：喹唑啉 - 4 - 基）；苯并噻唑基（如：苯并噻唑 - 2 - 基），吡唑基（如：吡唑 - 5 - 基）等。其中每个基团均可被任意取代。任意取代的吡啶基尤为优选。

10 当该杂环基被取代时，取代基包括：例如，Q 代表的上述芳基取代基。优选的取代基为卤原子，卤代（低级）烷基、烷氧基、烷氧羰基或甲酰基，较为优选的是氯原子或三氟甲基。取代基可处于环上的任何位置。取代基的数目是 1 至 5，优选 1 至 4，较为优选的是 1 至 3。取代基可以相同或不同。

15 Q 表示的一或二取代亚甲氨基例如可由下式（a）表示：



(a)

20 其中  $R^{12}$  和  $R^{13}$  可以相同或不同，是氢原子、任意取代的烷基、酰基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基、任意取代的氨基、环烷基、任意取代的芳基或任意取代的杂环基，或者  $R^{12}$  和  $R^{13}$  连在一起，形成一个一元环或多元环，该环可含有一个杂原子，条件是  $R^{12}$  和  $R^{13}$  中至少有一个不是氢原子。

25 式（a）中  $R^{12}$  或  $R^{13}$  表示的烷基包括：例如， $R^1$  代表的烷基或取代烷基。甲基和乙基尤为优选。

$R^{12}$  或  $R^{13}$  代表的酰基包括：例如，烷羰基、芳羰基等。烷羰基包括：例如  $C_1 - 6$  烷羰基，优选  $C_1 - 4$  烷羰基，例如乙酰基、三氟乙酰基、丙酰基、丁酰基等。芳羰基包括：例如， $C_6 - 14$  芳羰基，例如苄酰基、萘甲酰基等。

$R^{12}$  或  $R^{13}$  表示的烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基和任意取代的氨基分别是：例如， $R^1$  分别代表的烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基和任意取代的氨基。

$R^{12}$  或  $R^{13}$  表示的环烷基包括：含有 3 至 7 个碳原子，优选 5 至 6 个碳原子的环烷基，例如，环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基等。

$R^{12}$  或  $R^{13}$  代表的任意取代的芳基包括：例如， $C_6-14$  芳基，例如苯基、萘基（如：1-萘基等），苄基等。苯基尤为优选。该芳基可在环上的任何位置被取代。取代基的数目是 1 至 3。取代基的实例包括：卤原子、任意取代的烷基、任意取代的羧基、烷硫基、任意取代的氨基、硝基、苯基、氟基等。

$R^{12}$  或  $R^{13}$  表示的任意取代芳基的卤原子取代基实例包括：氟、氯、溴和碘。

作为  $R^{12}$  或  $R^{13}$  表示的任意取代芳基的取代基的任意取代烷基实例包括  $R^1$  代表的上述任意取代烷基。任意取代的烷基优选烷基或卤代烷基，特别优选甲基或三氟甲基。

作为  $R^{12}$  或  $R^{13}$  表示的任意取代芳基的取代基的任意取代羧基实例包括：羧基、烷氧基、链烯氧基、炔氧基、卤代烷氧基、芳氧基等。烷氧基包括：例如，含有 1 至 8 个碳原子，优选 1 至 4 个碳原子的烷氧基，例如甲氧基、乙氧基、丙氧基、丁氧基等。甲氧基尤为优选。链烯氧基包括：例如，含有 2 至 8 个，优选 2 至 4 个碳原子的链烯氧基。例如乙烯氧基、烯丙氧基、丁烯氧基等。烯丙氧基尤为优选。炔氧基包括：例如，含有 2 至 8 个碳原子，优选 2 至 4 个碳原子的炔氧基，例如乙炔氧基、炔丙氧基、丁炔氧基等。炔丙氧基尤为优选。卤代烷氧基包括：例如，被至少一个卤原子（如：氟、氯、溴、碘）取代的上述烷氧基，例如：二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯甲氧基等。二氟甲氧基尤为优选。芳氧基包括：例如，含有 6 至 12 个，优选 6 至 8 个碳原子的芳氧基，例如苯氧基、萘氧基等。

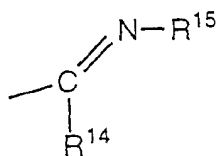
作为  $R^{12}$  或  $R^{13}$  表示的任意取代芳基的取代基的烷硫基实例包括：含有 1 至 8 个，优选 1 至 4 个，更优选 1 至 2 个碳原子的烷硫基，例如：甲硫基、乙硫基、丙硫基、丁硫基等。甲硫基最为优选。

作为  $R^{12}$  或  $R^{13}$  表示的任意取代芳基的取代基的任意取代氨基实例包括：氨基、被含有 1 至 8 个，优选 1 至 4 个碳原子的烷基一或二-取代的氨基（如：一甲基氨基、二甲基氨基、一乙基氨基等）等。

5 作为  $R^{12}$  或  $R^{13}$  表示的任意取代的杂环基包括：例如，含有 1 至 4 个，优选 1 至 2 个杂原子（例如：氧、氮、硫等）的杂环基。杂环在任何可能的位置与上述式 (a) 中亚甲基的碳原子相键连。杂环基的实例包括：吡啶基、吡嗪基、吡唑基、嘧啶基、咪唑基、噻吩基、噁唑基、异噁唑基、苯并噁唑基、喹啉基、喹唑啉基、吡嗪基、吗啉代、哌嗪基等。它们的优选实例包括：咪唑基（如：2-咪唑基等），噻吩基（如：2-噻吩基等），吡啶基（如：2-吡啶基等），吡嗪基（如：2-吡嗪基，等），嘧啶基（如：2-嘧啶基等）和吗啉代。该类杂环是未被取代或者被取代的。取代基包括  $R^{12}$  或  $R^{13}$  代表的上述任意取代芳基的取代基。

15  $R^{12}$  和  $R^{13}$  形成的并可含有 (a) 杂原子的一元或多元环是  $R^{12}$  和  $R^{13}$  与和它们相连的碳原子形成的 4-至 8-元环。该环含有至少一个杂原子（如：氧、氮、硫等），并且可与另一个环形成稠环。该环的实例包括环戊烷、环己烷、1,2-二氢化茚、1,2,3,4-四氢化萘、5,6,7,8-四氢喹啉、4,5,6,7-四氢苯并[b]咪唑等。该环在任何可能的位置带有一个双键。

20 Q 代表的任意取代（取代的亚氨基）甲基例如可用下式 (b) 表示：



(b)

25

其中  $R^{14}$  和  $R^{15}$  分别与上述  $R^{12}$  和  $R^{13}$  具有相同的含义。

Q 表示的任意取代烷基的烷基包括  $R^1$  代表的烷基。Q 表示的任意取代链烯基的链烯基包括：例如，含有 2 至 8 个，优选 3 至 6 个碳原子的链烯基，如：烯丙基、丙烯基、异丙烯基、丁烯基、异丁烯基、戊烯基、己烯基、己二烯基等。Q 表示的任意取代炔基的炔基包括：例如，含有 2 至 6 个，优选 2 至 4 个碳原子的炔基，例如炔丙基、乙炔基、丁炔基等。当上述烷基、链烯基和炔基被取代时，取代基是，例如：上述的卤原子、

烷氧基、烷硫基、烷基亚磺酰基、烷基磺酰基和取代的氨基，每个基团均用  $R^1$  表示；上述任意取代的苯基、任意取代的萘基和任意取代的杂环基，每个基团均用 Q 表示；等等。

5 Q 表示的取代羰基包括：例如，（任意取代烷基）羰基、（任意取代苯基）羰基、（任意取代萘基）羰基、（任意取代杂环基）羰基等。

Q 表示的取代磺酰基包括：例如，（任意取代烷基）磺酰基、（任意取代苯基）磺酰基、（任意取代萘基）磺酰基、（任意取代杂环基）磺酰基等。

10 在上述取代的羰基或取代的磺酰基中，任意取代的烷基包括  $R^1$  表示的上述任意取代烷基。任意取代苯基、任意取代萘基，和任意取代杂环基包括 Q 表示的相应基团。

Q 优选式 (XX) 基团，吡啶基、嘧啶基、喹啉基、喹唑啉基、苯并噻唑基或吡唑基，其中的每一个均可被取代或不被取代，或者是式 (a) 的基团。

15 X 是氢原子、卤原子、任意取代烷基或任意取代羟基。这里包括在上述式 (I) 中苯基不被取代，即：X 是氢原子的情况；以及苯基被选自下述基团中的 1 至 3 个取代基团在任何可能的位置取代的情况，所述基团包括：卤原子、任意取代的烷基和任意取代的羟基。当苯基被 2 或 3 个取代基取代时，这些取代基是相同或不同的。

20 X 表示的卤原子、任意取代烷基和任意取代羟基包括：例如， $R^1$  表示的各自相应的基团。

X 优选氢原子。

Y 表示的任意取代羟基和烷硫基包括：例如  $R^1$  代表的相应基团。其中甲氧基尤为优选。

25 Y 表示的任意取代的氨基例如可由下式 (XXI) 表示：



30 其中  $R^5$  是氢原子或烷基； $R^6$  是氢原子、烷基或羟烷基。 $R^5$  或  $R^6$  表示的烷基和  $R^6$  表示的羟烷基的烷基包括：例如， $R^1$  代表的上述烷基。 $R^5$  和  $R^6$  相同或不同地是氢原子或烷基（优选甲基）是优选的。当 Y 是一烷基氨基时式 (XXI) 基团更为优选，最为优选的是一甲基氨基。

优选的 Y 是烷氧基或式 (XXI) 基团, 甲氧基或一烷基氨基 ( 优选一甲基氨基 ) 更为优选。

Z 优选氧原子。

$R^2$  代表的烷基包括: 例如,  $R^1$  代表的上述烷基。甲基尤为优选。

- 5  $R^2$  代表的酰基包括甲酰基; 带有含 1 至 8 个, 优选 1 至 4 个碳原子烷基的烷羰基 ( 如: 乙酰基、丙酰基、丁酰基等 ); 苯甲酰基等。乙酰基较为优选。

M 优选氧原子、硫原子或  $NR^2$ , 氧原子更为优选。

n 优选 0 或 1。

- 10 本发明式 ( I ) 化合物在 2 - 位带有不对称碳原子。它们的每种旋光异构体及混合物均包括在本发明范围之内。

优选的式 ( I ) 化合物的实例是: 其中的

X 是氢原子、 $R^1$  是羟基、Z 是氧原子、Y 是被烷基任意取代的氨基、M 是氧原子、Q 是任意取代的苯基, 以及 n 是 0 或 1。

- 15 X 是氢原子、 $R^1$  是烷氧基、Z 是氧原子、Y 是烷氧基或任意取代的氨基、M 是氧原子、Q 是任意取代的苯基, 以及 n 是 0 或 1。

X 是氢原子、 $R^1$  是羟基、Z 是氧原子、Y 是被烷基任意取代的氨基、M 是氧原子、Q 是任意取代的杂环基, 以及 n 是 0 或 1。

- 20 X 是氢原子、 $R^1$  是烷氧基、Z 是氧原子、Y 是烷氧基或任意取代的氨基、M 是氧原子、Q 是任意取代的杂环基, 以及 n 是 0 或 1。

X 是氢原子、 $R^1$  是烷氧基、Z 是氧原子、Y 是被烷基任意取代的氨基、M 是氧原子、Q 是式 ( a ) 的基团、 $R^{12}$  是烷基、 $R^{13}$  是任意取代的苯基或任意取代的吗啉代, 以及 n 是 1, 或

- 25 X 是氢原子、 $R^1$  是烷氧基、Z 是氧原子、Y 是被烷基任意取代的氨基、M 是酰氨基、Q 是式 ( a ) 的基团、 $R^{12}$  是烷基、 $R^{13}$  是任意取代的苯基或任意取代的吗啉代, 以及 n 是 1。

式 ( I ) 化合物的较为优选的实例是: 其中的

X 是氢原子,  $R^1$  是羟基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是苯基, 以及 n 是 0 ( 化合物序号 1 );

- 30 X 是氢原子,  $R^1$  是羟基, Z 是氧原子, Y 是氨基, M 是氧原子, Q 是苯基, 以及 n 是 0 ( 化合物序号 2 );

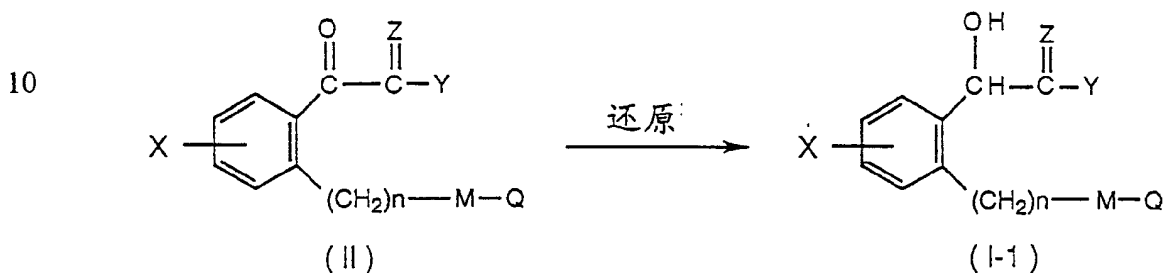
X 是氢原子,  $R^1$  是羟基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧

- 原子, Q 是 3,4 - 二甲基苯基, 以及 n 是 0 (化合物序号 15);
- X 是氢原子, R<sup>1</sup> 是羟基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 3,5 - 二甲基苯基, 以及 n 是 0 (化合物序号 16);
- 5 X 是氢原子, R<sup>1</sup> 是羟基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 2 - 甲基苯基, 以及 n 是 1 (化合物序号 64);
- X 是氢原子, R<sup>1</sup> 是羟基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 2,5 - 二甲基苯基, n 是 1 (化合物序号 75);
- X 是氢原子, R<sup>1</sup> 是羟基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 4 - 氯 - 2 - 甲苯基, n 是 1 (化合物序号 113);
- 10 X 是氢原子, R<sup>1</sup> 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是甲氧基, M 是氧原子, Q 是 2,5 - 二甲苯基, n 是 1 (化合物序号 139);
- X 是氢原子, R<sup>1</sup> 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 2,5 - 二甲苯基, n 是 1 (化合物序号 140);
- X 是氢原子, R<sup>1</sup> 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 4 - 氯 - 2 - 甲苯基, n 是 1 (化合物序号 186);
- 15 X 是氢原子, R<sup>1</sup> 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 2 - 甲苯基, n 是 1 (化合物序号 197);
- X 是氢原子, R<sup>1</sup> 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 3 - 氯 - 5 - 三氟甲基吡啶 - 2 - 基, n 是 1 (化合物序号 427);
- 20 X 是氢原子, R<sup>1</sup> 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 3,5 - 二氯吡啶 - 2 - 基, n 是 1 (化合物序号 433);
- X 是氢原子, R<sup>1</sup> 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 3 - 三氟甲基 - 5 - 氯吡啶 - 2 - 基, n 是 1 (化合物序号 448);
- 25 X 是氢原子, R<sup>1</sup> 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 3 - 氯吡啶 - 2 - 基, n 是 1 (化合物序号 466);
- X 是氢原子, R<sup>1</sup> 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是  $\alpha$  - 甲基 - 4 - 氯亚苄氨基, n 是 1 (化合物序号 474);
- 30 X 是氢原子, R<sup>1</sup> 是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是  $\alpha$  - 甲基 - 4 - 甲氧基亚苄氨基, n 是 1 (化合物序号 492);

X 是氢原子,  $R^1$  是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是 4,  $\alpha$  - 二甲基亚苄氨基, 和 n 是 1 (化合物序号 498); 或 X 是氢原子,  $R^1$  是甲氧基, Z 是氧原子, Y 是一甲基氨基, M 是氧原子, Q 是  $\alpha$  - 甲基 - 4 - 三氟甲基亚苄氨基, n 是 1 (化合物序号 526)。

包括在式 (I) 中的本发明化合物优选按如下方法制备。

#### 方法 A



15 其中每个符号定义同前。

本发明的式 (I - 1) 化合物可通过还原化合物 (II) 来制备。

使用的还原剂是还原酮的常规还原剂, 例如金属氢化物, 金属氢化物配位化合物等。还原剂的实例包括三 - 配位甲硼烷 (如甲硼烷等), 四 - 配位硼酸盐 (如硼氢化钠、硼氢化锂等), 三 - 配位铝 (如氢化二异丁基铝等), 四 - 配位铝配合物 (如氢化锂铝等), 等等。还原剂的用量是每摩尔化合物 (II) 0.25 至 3 摩尔, 优选 1.0 至 1.2 摩尔。

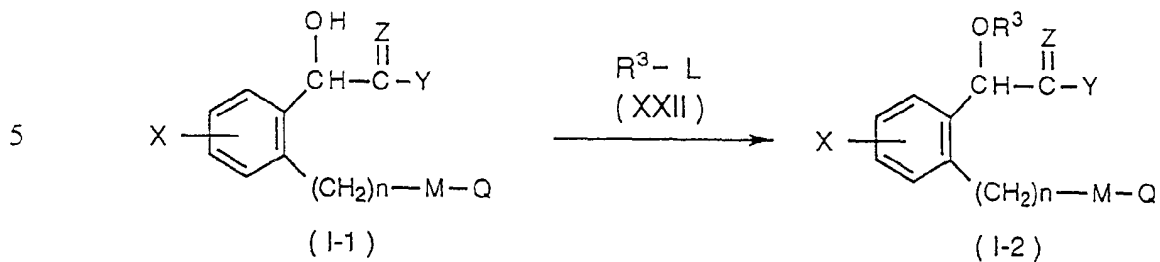
溶剂的实例包括醇, 例如甲醇、乙醇等; 醚, 例如乙醚、四氢呋喃等, 及水等等。这些溶剂可单独使用或以其混合物形式使用。

25 反应温度从  $-20^{\circ}\text{C}$  至溶剂的回流温度范围内适当选择, 优选  $0\sim 50^{\circ}\text{C}$ 。反应时间 0.5~24 小时, 优选 0.5~2.0 小时。

由此制得的本发明化合物 (I - 1) 可用已知的方法 (如色谱法, 重结晶等) 分离和提纯。

30 在该反应中用作起始原料的化合物 (II) 例如可按照 JP - A 3 - 246268, JP - A 5 - 97768 或 JP - A 5 - 331124 (所述方法) 使相应的卤代苯基与丁基锂或镁反应, 然后使所得化合物与草酸二烷基酯反应来制备。此外, 还可按下述方法 Q 来制备。

## 方法 B



其中  $\text{R}^3$  是烷基、链烯基、炔基、卤代烷基、卤代链烯基、卤代炔基、烷  
 10 氧基烷基、烷羰基、(烷硫基)羰基、烷基磺酰基、芳基磺酰基或一或  
 二-烷基取代的氨基甲酰基，L 是离去基团或  $\text{R}^3 - \text{L}$  代表二氢吡喃，其  
 它符号定义同上。

$\text{R}^3$  表示的基团是：例如，相应于  $\text{R}^1$  表示的上述被取代羟基的取代基  
 的基团。L 代表的离去基团包括：例如卤原子（如：氟、氯、溴、碘），  
 15 烷基磺酰氧基（如：甲磺酰氧基等）等等。

可使本发明化合物 (I-1) 与化合物 (XXII) 反应，将烷基、链烯基、  
 炔基、羰基、磺酰基、氨基甲酰基或四氢吡喃基导入化合物 (I-1)  
 来制备本发明化合物 (I-2)。

例如可在碱存在下，分别使用作为化合物 (XXII) 的烷基卤化物、链烯  
 20 基卤化物和炔基卤化物来导入烷基、链烯基和炔基。烷基卤化物包括：  
 例如，甲基氯、甲基溴、甲基碘、乙基氯、乙基溴、乙基碘、1-碘丙  
 烷、2-碘丙烷、1-碘丁烷、一氯三氟甲烷、1,2-二溴乙烷、氯甲基  
 醚等。链烯基卤化物包括：例如，烯丙基溴等。炔基卤化物包括：例如，  
 炔丙基溴等。对于每摩尔化合物 (I-1)，卤化物的用量是 1 ~ 5 摩  
 25 尔，优选 1 ~ 2 摩尔。

碱的实例包括有机碱（如甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾等），无机碱  
 （如：氢氧化钠、氢氧化钾、氢化钠、氢化钾等）等等。碱的用量为 1 ~  
 5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物 (I-1)。

溶剂的实例包括醚，例如：乙醚、四氢呋喃等，N,N-二甲基甲酰  
 30 胺，二甲亚砜、甲苯等。

反应温度从 -20 °C 至溶剂回流温度范围内适当选定，优选 0 ~ 50  
 °C。反应时间为 0.5 ~ 48 小时，优选 0.5 ~ 10 小时。

例如可使用酰卤（如乙酰氯、乙酰溴、丙酰氯、硫代乙酰氯等）或酸酐（如：乙酐、丙酐等）作为化合物（XXII）在碱存在下导入羰基。酰卤或酸酐的用量为1~5摩尔，优选1~2摩尔/摩尔化合物（I-1）。

5 碱的实例包括有机碱（如：三乙胺、N,N-二甲基苯胺、吡啶等）或无机碱（碳酸钠、碳酸钾、氯化钠等）。碱的用量为1~5摩尔，优选1~2摩尔/摩尔化合物（I-1）。

溶剂的实例包括卤代烃，例如二氯甲烷、氯仿等；醚，如乙醚，四氢呋喃等；N,N-二甲基甲酰胺，二甲亚砜，甲苯等。

10 反应温度从-20℃至溶剂的回流温度范围之间适当选择，优选0~50℃。反应时间为0.5~24小时，优选0.5~5小时。

例如可使用烷基磺酰卤（如：烷基磺酰氯，例如甲磺酰氯、乙磺酰氯等）或芳基磺酰卤（例如：芳基磺酰氯，如苯磺酰氯、对-甲苯磺酰氯等）作为化合物（XXII），在碱存在条件下导入磺酰基。烷基磺酰卤或芳基磺酰卤的用量为1~5摩尔，优选1~2摩尔/摩尔化合物（I-1）。

15 碱的实例包括有机碱（如：三乙胺、N,N-二甲基苯胺、吡啶等）或无机碱（如：碳酸钠、碳酸钾、氯化钠等）。碱的用量为1~5摩尔，优选1~2摩尔/摩尔化合物（I-1）。

20 溶剂的实例包括卤代烃，例如二氯甲烷、氯仿等；醚，如乙醚、四氢呋喃等；N,N-二甲基甲酰胺，二甲亚砜，甲苯等。

反应温度从-20℃至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选0~50℃。反应时间0.5~24小时，优选0.5~5小时。

25 例如可使用N-未被取代的或N-烷基取代的氨基甲酰卤（如：一乙基氨基甲酰氯，二甲基氨基甲酰氯等）作为化合物（XXII），导入氨基甲酰基。氨基甲酰卤的用量为1~5摩尔，优选1~2摩尔/摩尔化合物（I-1）。

30 碱的实例包括有机碱（如：三乙胺，N,N-二甲基苯胺、吡啶等）或无机碱（如：碳酸钠、碳酸钾、氯化钠等）。碱的用量为1~5摩尔，优选1~2摩尔/摩尔化合物（I-1）。

溶剂的实例包括卤代烃，例如二氯甲烷、氯仿等；醚，例如乙醚、四氢呋喃等；N,N-二甲基甲酰胺，二甲亚砜，甲苯等。

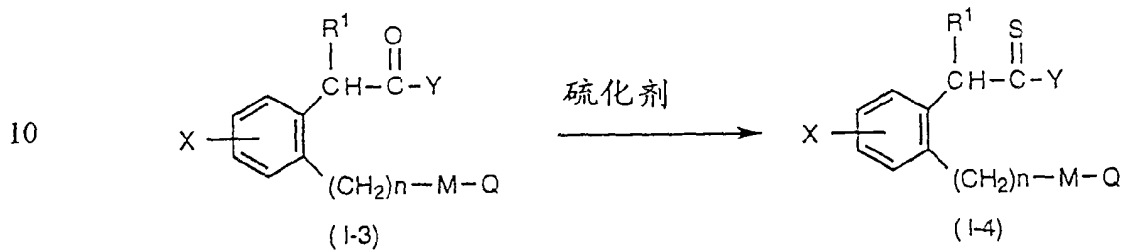
反应温度从-20℃至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选20~

70 °C。反应时间为 0.5 ~ 48 小时，优选 0.5 ~ 12 小时。

可使用常规方法，用四氢吡喃基保护羟基来导入四氢吡喃基，例如可用与下述方法 Y 相同的方法导入四氢吡喃基。

由此制得的本发明化合物 ( I - 2 ) 可用常规方法 ( 如色谱法，重  
5 结晶等 ) 分离和提纯。

### 方法 C



其中每个符号定义同前。

15 可使本发明式 ( I - 3 ) 化合物与硫化剂 ( 即硫导入剂 ) 反应制备本发明化合物 ( I - 4 )。

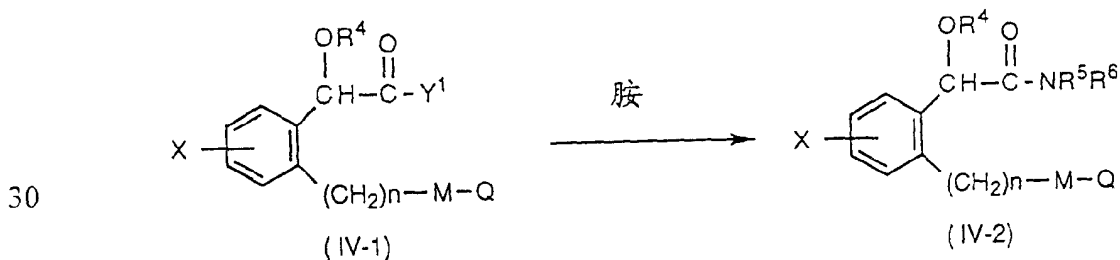
硫化剂包括：例如，五硫化二磷和 Lawesson 试剂。硫化剂的用量为 1 ~ 5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物 ( I - 3 )。

20 溶剂的实例包括芳烃，例如甲苯、二甲苯等；以及吡啶。这些溶剂可以单独使用，或以混合物形式使用。

反应温度从室温至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选 80 ~ 150 °C。反应时间为 0.5 ~ 48 小时，优选 0.5 ~ 12 小时。

由此制得的本发明化合物 ( I - 4 ) 可用已知方法 ( 如色谱法、重  
25 结晶等 ) 分离和提纯。

### 方法 D



其中  $R^4$  是烷基、链烯基、炔基、卤代烷基、卤代链烯基、卤代炔基或烷氧基烷基， $R^5$  是氢原子或烷基， $R^6$  是氢原子、烷基或羟烷基， $Y^1$  是烷氧基或烷硫基，其它符号定义同前。

$R^4$  表示的基团是，例如相应于  $R^1$  代表的前述取代羟基的取代基的基团。 $Y^1$  代表的烷氧基和烷硫基包括：例如  $R^1$  分别代表的前述烷氧基和烷硫基。

可使化合物 (IV - 1) 与胺反应制备本发明的化合物 (IV - 2)。

胺包括式 (V) 化合物： $R^5R^6NH$  (其中  $R^5$  和  $R^6$  定义同前)。它们的实例包括液氨；伯胺，如甲胺、乙胺等；仲胺，如二甲胺，二乙胺等。胺的用量为 1 ~ 5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物 (IV - 1)。

溶剂的实例包括醇，如甲醇、乙醇等；芳烃，如甲苯；二甲苯等；卤代烃，如二氯甲烷、氯仿等；醚，如乙醚、四氢呋喃等；和水。这些溶剂可以单独使用或以混合物形式使用。

反应温度从 0 °C 至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选 20 ~ 80 °C。反应时间为 0.5 ~ 48 小时，优选 0.5 ~ 12 小时。

由此制得的本发明化合物 (IV - 2) 可用已知方法 (如色谱法、重结晶等) 分离和提纯。

#### 方法 E

20



25

其中 A 是卤原子，其它符号定义同前。

A 表示的卤原子包括：例如，氟、氯、溴和碘。

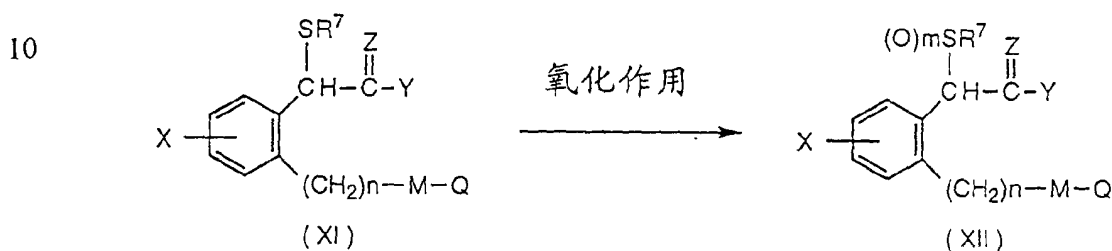
可通过卤代本发明化合物 (I - 1) 来制备本发明化合物 (I - 5)。在卤代中使用的卤化剂包括：例如，氯化剂，如亚磺酰氯、磷酰氯、五氯化磷，四氯化碳 - 三苯基膦等；溴化剂，如亚磺酰溴，三溴化磷，四溴化碳 - 三苯基膦等。卤化剂用量为 1 ~ 5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物 (I - 1)。

溶剂的实例包括芳烃，例如甲苯、二甲苯等；卤代烃，如二氯甲烷、氯仿等；醚；如乙醚、四氢呋喃等。

反应温度从 0 °C 至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选 20 °C ~ 80 °C。反应时间为 0.5 ~ 48 小时，优选 0.5 ~ 12 小时。

5 由此制得的本发明化合物 ( I - 5 ) 可用已知方法 ( 如色谱法、重结晶等 ) 分离和提纯。

#### 方法 F



15

其中 R<sup>7</sup> 是烷基、m 是 1 或 2，其它符号定义同前。

R<sup>7</sup> 代表的烷基包括：例如，R<sup>1</sup> 代表的上述烷基。

20 可通过氧化本发明的化合物 ( XI ) 制得本发明的化合物 ( XII )。氧化中使用的氧化剂包括：例如，过氧化氯，过酸，如过乙酸、过苯甲酸、间-氯过苯甲酸等，偏高碘酸钠，氢过氧化物等。氧化剂的用量为 1 ~ 10 摩尔，优选 1 ~ 3 摩尔/摩尔化合物 ( XI )。

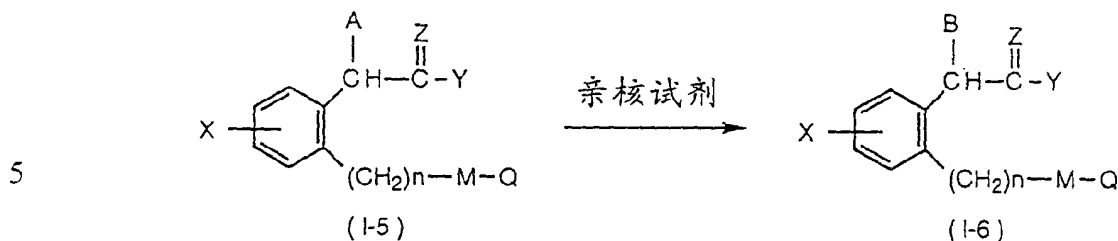
溶剂的实例包括芳烃，如甲苯、二甲苯等；卤代烃，如二氯甲烷、氯仿等，醚，如乙醚、四氢呋喃等；醇，如甲醇、乙醇等；和水。这些溶剂可以单独使用或以混合物形式使用。

25 反应温度从 - 20 °C 至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选 0 °C ~ 50 °C。反应时间为 0.5 ~ 48 小时，优选 0.5 ~ 12 小时。

由此制得的本发明化合物 ( XII ) 可用已知方法 ( 如色谱法，重结晶等 ) 分离和提纯。

#### 方法 G

30



其中 A 是卤原子，B 是任意取代的羟基、烷硫基。被烷基任意取代的氨基、或硝基。其它符号定义同上。

10 B 表示的基团包括：例如， $R^1$  代表的上述相应基团。

可使本发明化合物 (I-5) 与亲核试剂反应取代基团 A 来制备本发明化合物 (I-6)。

例如，当 A 被取代羟基取代时，例如可将醇的金属盐（如：甲醇钠、2-丙烯醇钠、2-炔丙醇钾、2,2,2-三氟乙醇钾，甲氧基 甲醇钠等）  
15 直接用作亲核试剂，或在反应中使用在反应混合物中由醇和金属氢化物（如氢氧化钠、氢氧化钾等）生成的醇的金属盐。在这两种情况下，醇的金属盐的用量为 1 ~ 5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物 (I-5)。

使用的溶剂的实例包括芳烃，例如甲苯、二甲苯等；卤代烃，如二氯甲烷，氯仿等；醚，如乙醚，四氢呋喃等；N,N-二甲基甲酰胺和二  
20 甲亚砷。

反应温度从 0 °C 至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选 20 °C ~ 80 °C。反应时间为 0.5 ~ 48 小时，优选 0.5 ~ 12 小时。

当基团 A 被烷硫基取代时，例如，可直接将烷基硫醇的金属盐（如硫代甲醇钠、硫代乙醇钠等）用做亲核试剂，或者在反应中使用反应混  
25 合物中从烷基硫醇和金属氢化物（如氢氧化钠、氢氧化钾等）或氢氧化物（如氢氧化钠、氢氧化钾等），生成的烷基硫醇的金属盐。在这两种情况下，烷基硫醇的金属盐的用量为 1 ~ 5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物 (I-5)。

使用的溶剂的实例包括芳烃，如甲苯，二甲苯等；醚，如乙醚，四  
30 氢呋喃等；乙腈，N,N-二甲基甲酰胺、二甲亚砷和水。这些溶剂可以单独使用或以混合物形式使用。

反应温度从 0 °C 至溶剂的回流温度范围内适当选定，优选 20 °C ~ 80

℃。反应时间为 0.5 ~ 48 小时，优选 0.5 ~ 12 小时。

当基团 A 被由烷基任意取代的氨基取代时，例如可将胺（如液氨、氨水、一甲基胺、二甲胺等）用作亲核试剂，其用量为 1 ~ 5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物（I - 5）。

- 5 使用的溶剂的实例包括：芳烃，例如甲苯、二甲苯等；醚，如乙醚、四氢呋喃等；醇，如甲醇、乙醇等；N,N - 二甲基甲酰胺、二甲亚砜和水。这些溶剂可单独使用或以其混合物形式使用。

反应温度从 - 20 ℃ 至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选 0 ℃ ~ 80 ℃。反应时间为 0.5 ~ 48 小时，优选 0.5 ~ 12 小时。

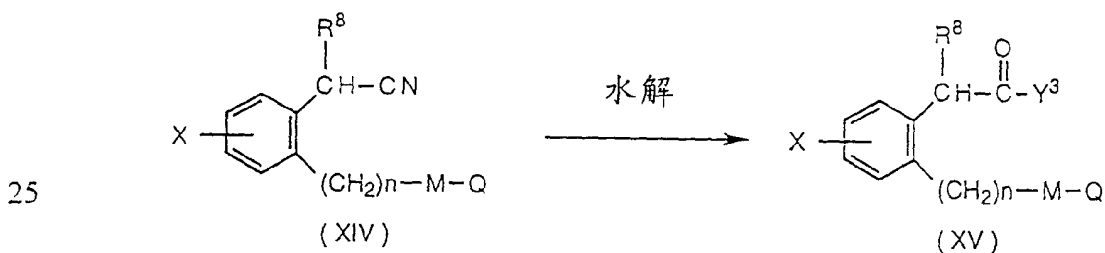
- 10 当基团 A 被硝基取代时，例如，亚硝酸盐（如，亚硝酸钠、亚硝酸钾等）被用作亲核试剂，其用量为 1 ~ 5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物（I - 5）。此外，间苯三酚的用量为 1 ~ 5 摩尔，优选的 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物（I - 5）。

使用的溶剂的实例包括：芳烃，如甲苯、二甲苯等；醚，如乙醚、四氢呋喃等；醇，如甲醇、乙醇等；N,N - 二甲基甲酰胺和二甲亚砜。

- 15 反应温度从 0 ℃ 至溶剂的回流温度范围内适当选定，优选 20 ℃ ~ 80 ℃。反应时间为 0.5 ~ 48 小时，优选 0.5 ~ 12 小时。

由此制得的本发明化合物（I - 6）可用已知方法（如色谱法、重结晶等）分离和提纯。

20 方法 H



其中  $\text{R}^8$  是烷基、卤代烷基或烷氧基烷基， $\text{Y}^3$  是羟基或氨基，其它符号定义同前。

- 30  $\text{R}^8$  表示的基团包括，例如， $\text{R}^1$  代表的上述相应基团。

可用酸或碱水解化合物(XIV)制备本发明化合物(XV)。

酸的实例包括无机酸（如盐酸、氢溴酸、硫酸、硝酸、磷酸等）和

有机酸(如, 甲酸、乙酸等)。这些酸可以单独使用或以其混合物形式使用。碱的实例包括有机碱(如: 乙醇钠等)和无机碱(如: 氢氧化钠、氢氧化钾等)。酸或碱的用量是1~10摩尔, 优选1~3摩尔/摩尔化合物(XIV)。

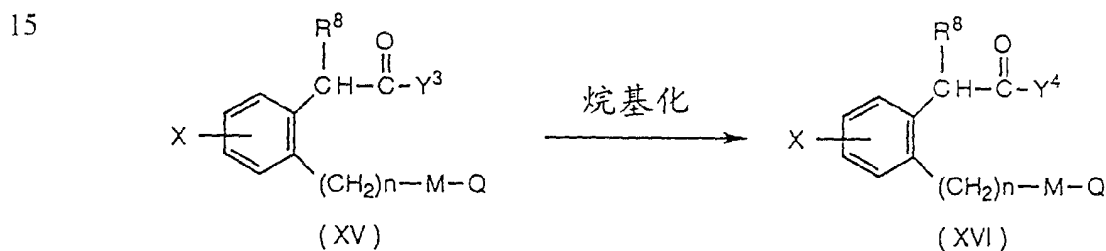
5 使用的溶剂的实例包括: 芳烃, 例如甲苯、二甲苯等; 醚, 如乙醚、四氢呋喃等; 醇, 如甲醇、乙醇等; N,N-二甲基甲酰胺、二甲亚砜和水等。这些溶剂可单独使用或以其混合物形式使用。

反应温度从-80℃至溶剂的回流温度范围内适当选择, 优选0℃~80℃。反应时间为0.5~48小时, 优选0.5~6小时。

10 由此制得的本发明化合物(XV)可用已知方法(如: 色谱法、重结晶等)分离和提纯。

在该反应中用作起始物的化合物(XIV)例如可按下述方法R制备。

#### 方法 I



20

其中  $\text{Y}^4$  是烷氧基、一或二烷基取代氨基, 其它符号定义同前。

$\text{Y}^4$  表示的基团包括  $\text{R}^1$  代表的上述相应基团。

本发明的化合物(XVI)可通过将本发明化合物(XV)烷基化制得。可在碱存在条件下使用烷基卤化物进行烷基化。烷基卤化物的实例包括

25 甲基氯、甲基溴、甲基碘、乙基氯、乙基溴、乙基碘、1-碘丙烷、2-碘丙烷、1-碘丁烷等。烷基卤化物的用量为1~5摩尔, 优选1~2摩尔/摩尔化合物(XV)。

碱的实例包括: 有机碱(如丁基锂、乙醇钠等)和无机碱(如氢氧化钠、氢氧化钾、氨基钠、氢化钠等)。碱的用量为1~5摩尔, 优选1~

30 2摩尔/摩尔化合物(XV)。

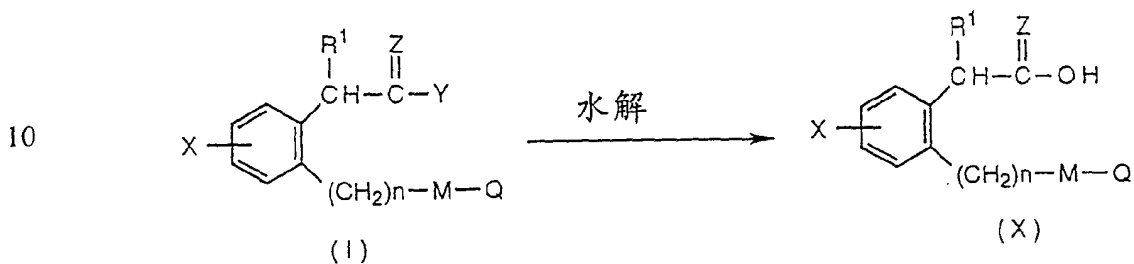
使用的溶剂包括: 芳烃, 如甲苯、二甲苯等; 卤代烃, 例如二氯甲烷、氯仿等; 醚, 如乙醚、四氢呋喃等; 醇, 如甲醇、乙醇等; N,N-

二甲基甲酰胺和二甲基亚砷等。

反应温度从  $-80^{\circ}\text{C}$  至溶剂的回流温度范围内适当选定, 优选  $0^{\circ}\text{C}$  ~  $80^{\circ}\text{C}$ 。反应时间为 0.5 ~ 48 小时, 优选 0.5 ~ 6 小时。

由此制得的本发明化合物(XVI)可用已知方法(如色谱法、重结晶等)进行分离和提纯。

### 方法 J



其中每个符号定义同前。

15 可在适当溶剂中水解本发明化合物(I)制得本发明化合物(X)。

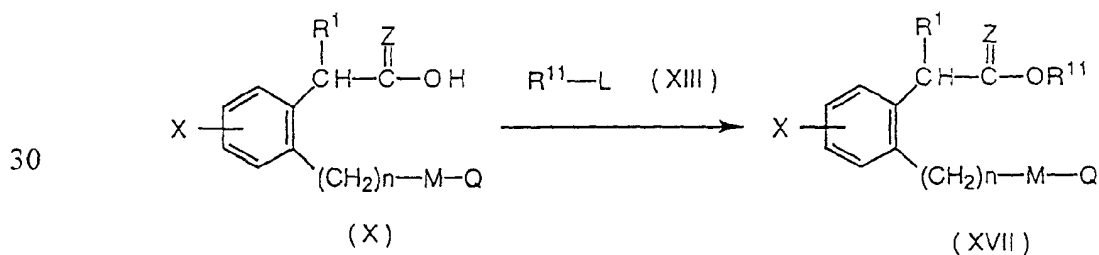
可用碱处理化合物(I)进行水解。碱的实例包括有机碱(如金属醇盐, 如乙醇钠等)和无机碱(如金属氢氧化物, 如氢氧化钠、氢氧化钾等)。碱的用量为 1 ~ 10 摩尔, 优选 1 ~ 3 摩尔/摩尔化合物(I)。

20 使用的溶剂包括: 芳烃, 如甲苯、二甲苯等; 醚, 例如乙醚、四氢呋喃等; 醇, 如甲醇、乙醇等; N,N-二甲基甲酰胺、二甲基亚砷、水等。这些溶剂可单独使用或合用。

反应温度从  $-80^{\circ}\text{C}$  至溶剂的回流温度范围内适当选定, 优选  $0^{\circ}\text{C}$  ~  $80^{\circ}\text{C}$ 。反应时间为 0.5 ~ 48 小时, 优选 0.5 ~ 6 小时。

25 由此制得的本发明化合物(X)可用已知方法(如色谱法、重结晶等)进行分离和提纯。

### 方法 K



其中  $R^{11}$  是烷基、链烯基或炔基，其它符号定义同前。

可使本发明化合物 (X) 与化合物(XIII)反应制备本发明化合物(XVII)。

例如，可在碱存在的条件下使用烷基卤化物、链烯基卤化物或炔基  
5 卤化物作为化合物(XIII)参与完成该反应。烷基卤化物包括：例如，甲基  
氯、甲基溴、甲基碘、乙基氯、乙基溴、乙基碘、1-碘丙烷、2-碘  
丙烷、1-碘丁烷、一氯三氟甲烷、1,2-二溴乙烷、氯甲基醚等。链烯  
基卤化物包括：例如，烯丙基溴等。炔基卤化物包括：例如，炔丙基溴  
等。卤化物的用量为 1 ~ 5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物 (X)。

10 碱的实例包括有机碱（如：甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾等），无机  
碱（如氢氧化钠、氢氧化钾、氢化钠、氢化钾等）等等。碱的用量为 1 ~  
5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物 (X)。

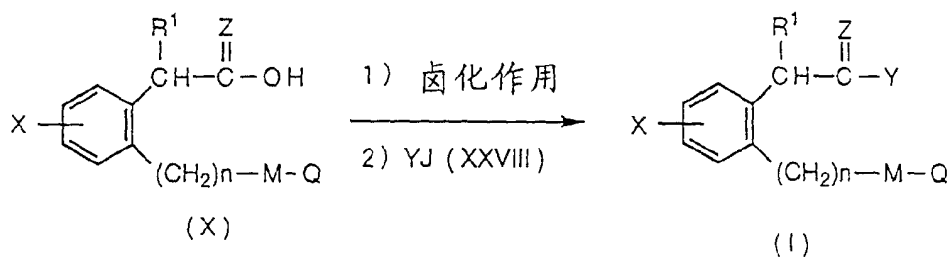
使用的溶剂的实例包括：例如乙醚、四氢呋喃等；N,N-二甲基甲  
酰胺、二甲亚砜、甲苯等。

15 反应温度从 -20 °C 至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选 0 °C ~  
50 °C。反应时间为 0.5 ~ 48 小时，优选 0.5 ~ 10 小时。

由此得到的本发明的化合物(XVII)可用已知方法（如色谱法、重结晶  
等）分离和提纯。

#### 方法 L

20



25

其中 J 是氢原子或金属盐，其它符号定义同前。

可通过卤代本发明化合物 (X)，然后使所得化合物与化合物  
(XXVIII)反应，制得本发明的化合物 (I)。

30 J 表示的金属盐实例包括：碱金属盐（钠盐、钾盐等），碱土金属盐  
（镁盐、钙盐等）等等。

可在催化量的碱，如 N,N - 二甲基甲酰胺的存在下，使用磺酰卤进行卤化作用，磺酰卤的用量为 1 ~ 5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物 (X)。

磺酰卤包括：例如，磺酰氯和磺酰溴。

- 5 使用的溶剂实例包括：卤代烃，如二氯甲烷、1,2 - 二氯乙烷等；醚，例如乙醚等；芳烃，如甲苯等。

反应温度从室温至溶剂的回流温度范围内适当选择。反应时间为 0.5 小时 ~ 24 小时，优选 1 ~ 5 小时。

由此制得的酰卤可不经提纯即在下一步骤中使用。

- 10 在碱的存在下，使该酰卤与醇、硫醇、胺或它的金属盐 YJ(XXVIII) 反应，将其转化为化合物 (I)。

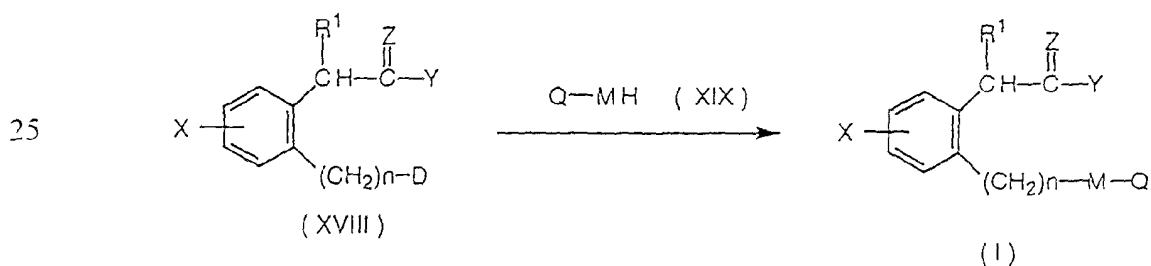
碱的实例包括：有机碱（如：三乙胺、N,N - 二甲基苯胺、吡啶等）和无机碱（如：碳酸钠、碳酸钾、氯化钠等）。碱的用量为 1 ~ 5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔酰卤。

- 15 使用的溶剂实例包括：卤代烃，如二氯甲烷、1,2 - 二氯乙烷等；醚，如乙醚等；芳烃，如甲苯等；二甲亚砜、N,N - 二甲基甲酰胺等。

反应温度从 0 °C 至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选 0 °C 至室温。反应时间为 0.5 ~ 24 小时，优选 0.5 ~ 2 小时。

- 20 由此制得的本发明化合物 (I) 可用已知方法（如色谱法、重结晶等）分离和提纯。

### 方法 M



其中 D 是卤原子，其它符号定义同前。

- 30 可在适当溶剂中使化合物 (XVIII) 与化合物 (XIX) 反应制得本发明化合物 (I)。

在上式中 D 表示的卤原子包括：例如氟、氯、溴和碘。

化合物 (XIX) 的用量为 1 ~ 3 摩尔, 优选 1 ~ 1.5 摩尔/摩尔化合物(XVIII)。

该反应优选在碱存在的条件下进行。碱的实例包括有机碱 (如: 醇盐, 例如甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾等; 胺, 例如吡啶、三乙胺等),  
5 无机碱 (如: 金属氢氧化物, 例如氢氧化钠、氢氧化钾等; 金属碳酸盐, 例如碳酸钠、碳酸钾等; 氢化物, 例如氢化钠、氢化钾等) 等等。碱的用量为 1 ~ 5 摩尔, 优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物(XVIII)。

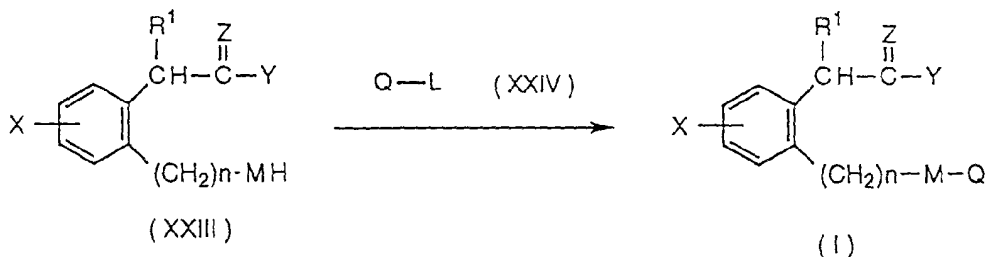
使用的溶剂包括: 醚, 如乙醚、四氢呋喃等; N,N - 二甲基甲酰胺、二甲亚砜, 甲苯等。

10 反应温度从 - 20 °C 至溶剂的回流温度范围内适当选定, 优选 0 °C ~ 50 °C。反应时间为 0.5 ~ 72 小时, 优选 0.5 ~ 10 小时。

由此得到的本发明的化合物 (I) 可用已知方法 (如色谱法、重结晶等) 分离和提纯。

#### 方法 N

15



20

其中 L 是离去基团, 其它符号定义同前。

可使化合物(XXIII)与化合物(XXIV)反应制备本发明化合物 (I)。

在化合物(XXIV)中, L 与 Q 上的任何可能位置相连。优选的化合物  
25 (XXIV)实例包括: 烷基卤化物 (如甲基氯、甲基溴、甲基碘、乙基氯、乙基溴、乙基碘、1 - 碘丙烷、2 - 碘丙烷、1 - 碘丁烷、一氯三氟甲烷、1,2 - 二溴乙烷、氯甲基醚等); 链烯基卤化物 (如烯丙基 溴等); 炔基卤化物 (如炔丙基溴等); 酰卤 (如乙酰氯、乙酰溴、丙酰氯、硫代乙酰氯等), 酸酐 (如乙酐、丙酐等); 烷基磺酰卤 (如烷基磺酰氯,  
30 例如: 甲磺酰氯、乙磺酰氯等); 芳基磺酰卤 (如, 芳基磺酰氯, 例如: 苯磺酰氯、对 - 甲苯磺酰氯等); N - 未被取代或 N - 烷基取代氨基甲酰卤 (如, 一乙基氨基甲酰氯、二甲基氨基甲酰氯等); 吡啶和其衍生

物(如, 2,3 - 二氯吡啶、2,5 - 二氯吡啶、2 - 氯 - 3 - 三氟甲基吡啶、2 - 氯 - 5 - 三氟甲基吡啶、2 - 氯 - 3 - 甲基吡啶、2,3,5 - 三氯吡啶、2,3 - 二氯 - 5 - 三氟甲基吡啶、2,5 - 二氯 - 3 - 氟甲基吡啶等); 嘧啶和其衍生物(如, 4,6 - 二氯嘧啶、2 - 氯 - 4,6 - 二甲基嘧啶、4 - 氯 - 5 - 乙氧羰基 - 6 - 乙基嘧啶等); 吡唑和其衍生物(如, 5 - 氯 - 4 - 甲酰基 - 1 - 甲基吡唑, 5 - 氯 - 4 - 甲氧基羰基 - 1,3 - 二甲基吡唑等); 喹啉和其衍生物(如, 4 - 氯喹啉等); 苯并噻唑和其衍生物(如, 2 - 氯苯并噻唑等); 喹唑啉和其衍生物(如, 4 - 氯喹唑啉等); 苯及其衍生物(如, 1 - 碘 - 4 - 硝基苯, 1 - 溴 - 4 - 三氟甲基苯等); 等等。

例如, 当 Q 是任意取代的芳基时, 可在碱存在下使用化合物(XXIV)来完成反应, 其用量为 1 ~ 5 摩尔, 优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物(XXIII)。碱的实例包括: 有机碱(如, 三乙胺、N,N - 二甲基苯胺、吡啶等), 无机碱(如, 碳酸钠、碳酸钾、氢氧化钠等)等等。碱的用量为 1 ~ 5 摩尔, 优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物(XXIII)。溶剂的实例包括醚, 如四氢呋喃等; 芳烃, 如甲苯等; 二甲亚砜、N,N - 二甲基甲酰胺等。温度为室温至 200 °C, 优选 100 ~ 150 °C, 反应时间 1 ~ 48 小时, 优选 2 ~ 24 小时。

例如, 当 Q 是任意取代的杂环基时, 可在碱存在下, 使用化合物(XXIV)完成该反应, 其中化合物(XXIV)的用量为 1 ~ 5 摩尔, 优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物(XXIII)。碱的实例包括有机碱(如, 三乙胺、N,N - 二甲基苯胺、吡啶等), 无机碱(如, 碳酸钠、碳酸钾、氢氧化钠等), 等等。碱的用量为 1 ~ 5 摩尔, 优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物(XXIII)。溶剂的实例包括醚, 如四氢呋喃等; 芳烃, 如甲苯等; 二甲亚砜; N,N - 二甲基甲酰胺; 等等。反应温度 0 ~ 150 °C, 优选室温 ~ 80 °C, 反应时间 0.5 ~ 48 小时, 优选 2 ~ 12 小时。

例如, 当 Q 是烷基、链烯基或炔基时, 其中每种基团均可被取代, 可在碱存在下, 使用化合物(XXIV)完成该反应, 化合物(XXIV)的用量为 1 ~ 5 摩尔, 优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物(XXIII)。碱的实例包括有机碱(如, 甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾等), 无机碱(如, 氢氧化钠、氢氧化钾、氢氧化钠、氢氧化钾等)等等。碱的用量为 1 ~ 5 摩尔, 优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物(I - 1)。溶剂的实例包括醚, 例如乙醚、四氢呋喃

等；N,N-二甲基甲酰胺、二甲亚砜、甲苯等。反应温度从-20℃至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选0~50℃。反应时间0.5~48小时，优选0.5~10小时。

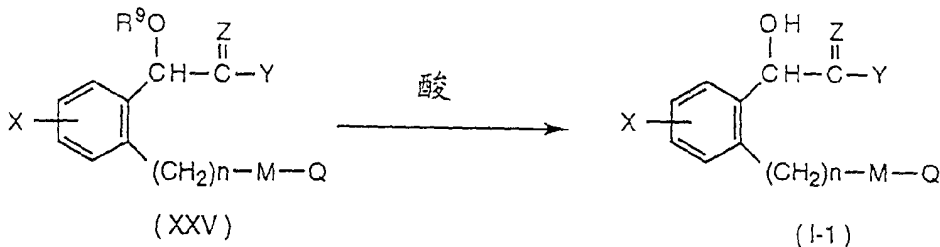
例如，当Q是取代羰基时，可在碱存在下，使用化合物(XXIV)完成该反应，化合物(XXIV)的用量为1~5摩尔，优选1~2摩尔/摩尔化合物(XXIII)。碱的实例包括：有机碱（如三乙胺、N,N-二甲基苯胺、吡啶等）和无机碱（如氢氧化钠、氢氧化钾、氯化钠等）。碱的用量为1~5摩尔，优选1~2摩尔/摩尔化合物(XXIII)。使用的溶剂的实例包括：卤代烃，如二氯甲烷、氯仿等；醚，如乙醚、四氢呋喃等；N,N-二甲基甲酰胺、二甲亚砜、甲苯等。反应温度从-20℃至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选0~70℃，20~50℃更为优选。反应时间为0.5~48小时，优选0.5~12小时，0.5~5小时更为优选。

例如，当Q是取代磺酰基时，可在碱存在下，使用化合物(XXIV)完成该反应。化合物(XXIV)的用量为1~5摩尔，优选1~2摩尔/摩尔化合物(XXIII)。碱的实例包括：有机碱（如，三乙胺、N,N-二甲基苯胺、吡啶等）和无机碱（如，碳酸钠、碳酸钾、氯化钠等）。碱的用量为1~5摩尔，优选1~2摩尔/摩尔化合物(XXIII)。使用的溶剂的实例包括：卤代烃，如二氯甲烷、氯仿等；醚，如乙醚、四氢呋喃等；N,N-二甲基甲酰胺、二甲亚砜、甲苯等。反应温度从-20℃至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选0~50℃。反应时间为0.5~24小时，优选0.5~5小时。

由此制得的本发明化合物(I)可用已知方法（如色谱法、重结晶等）分离和提纯。

#### 方法O

25



30

其中R<sup>9</sup>是四氢吡喃基。

可用酸处理化合物(XXV)制得本发明化合物(I-1)。

R<sup>9</sup>表示的四氢吡喃基包括：例如，2-四氢吡喃基等。

可在适当溶剂中，使用酸处理化合物(XXV)制得本发明化合物(I-1)。

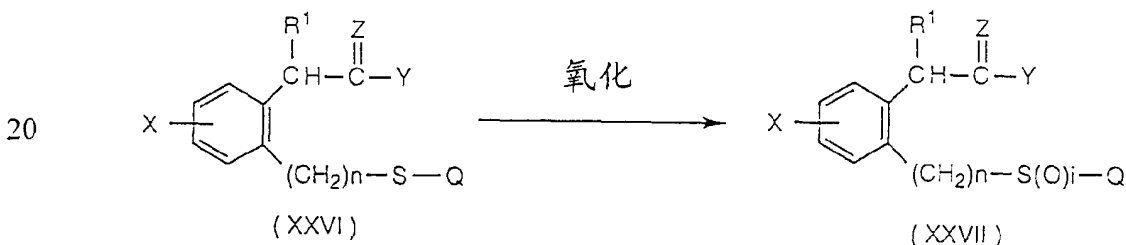
- 5 在该反应中使用的酸的实例包括：无机酸，如盐酸、氢溴酸、硝酸、硫酸等；磺酸类，如对-甲苯磺酸等；酸-碱对，如对-甲苯磺酸吡啶鎓等；等等。酸的用量为0.01~0.5摩尔，优选0.05~0.2摩尔/摩尔化合物(XXV)。

- 10 使用的溶剂包括：醇，如甲醇、乙醇等；芳烃，如甲苯、二甲苯等；卤代烃，如二氯甲烷，氯仿等；醚，例如乙醚、四氢呋喃等；和水。这些溶剂可以单独使用或以混合物形式使用。

反应温度可从0℃至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选20℃~80℃，反应时间为0.5~48小时，优选0.5~12小时。

- 15 由此制得的本发明化合物(I-1)可用已知方法(如色谱法、重结晶等)分离和提纯。

#### 方法P



其中每一符号的定义均同前述。

- 25 可通过氧化本发明化合物(XXVI)制得本发明的化合物(XXVII)。氧化中使用的氧化剂实例包括：过酸，如过氧化氢、过乙酸、过苯甲酸、间-氯过苯甲酸等，偏高碘酸钠、氢过氧化物等。氧化剂的用量为1~10摩尔。优选的1~3摩尔/摩尔化合物(XXVI)。

- 30 使用的溶剂实例包括：芳烃，如甲苯、二甲苯等；卤代烃，如二氯甲烷、氯仿等；醚，如乙醚、四氢呋喃等；醇，如甲醇、乙醇等；和水。这些溶剂可以单独使用或以混合物形式使用。

反应温度从  $-20^{\circ}\text{C}$  至溶剂的回流温度范围内适当选定, 优选  $0^{\circ}\text{C} \sim 50^{\circ}\text{C}$ 。反应时间  $0.5 \sim 48$  小时, 优选  $0.5 \sim 12$  小时。

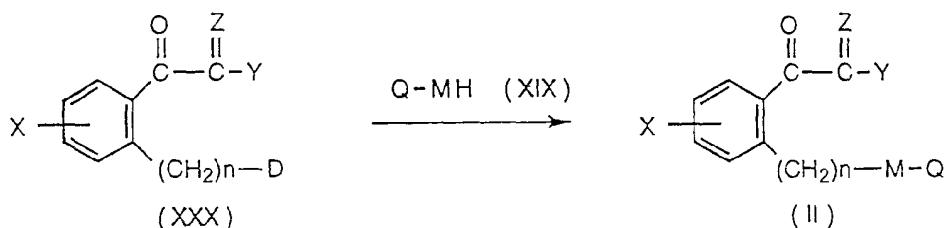
由此制得的本发明化合物(XXVII)可用已知方法(如色谱法、重结晶等)分离和提纯。

5 下述方法用于在本发明化合物的上述制备中用作起始原料的化合物的制备。

可在方法 A 的反应中用作起始原料的化合物(II)优选下述方法 Q 制备。

### 方法 Q

10



15

其中每一符号定义同前。

可在适当溶剂中, 于碱存在下, 使化合物(XXX)与化合物(XIX)反应制备化合物(II)。

20 化合物(XIX)的用量为  $1 \sim 3$  摩尔, 优选  $1 \sim 1.5$  摩尔/摩尔化合物(XXX)。

25 碱的实例包括: 有机碱(如: 醇盐, 例如甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾等; 胺, 如吡啶、三乙胺等), 无机碱(如, 金属氢氧化物, 例如氢氧化钠、氢氧化钾等; 金属碳酸盐, 如碳酸钠、碳酸钾等; 氢化物, 例如氢化钠、氢化钾等)等等。碱的用量为  $1 \sim 5$  摩尔, 优选  $1 \sim 2$  摩尔/摩尔化合物(XXX)。

使用的溶剂的实例包括醚, 如乙醚、四氢呋喃等; N,N-二甲基甲酰胺、二甲亚砜、甲苯等。

反应温度从  $-20^{\circ}\text{C}$  至溶剂的回流温度范围内适当选择, 优选  $0^{\circ}\text{C} \sim 50^{\circ}\text{C}$ 。反应时间  $0.5 \sim 48$  小时, 优选  $0.5 \sim 10$  小时。

30 由此制得的化合物(II)可以以反应混合物或粗产物形式, 或在用已知方法(如色谱法、重结晶等)分离和提纯后在下一步骤中使用。

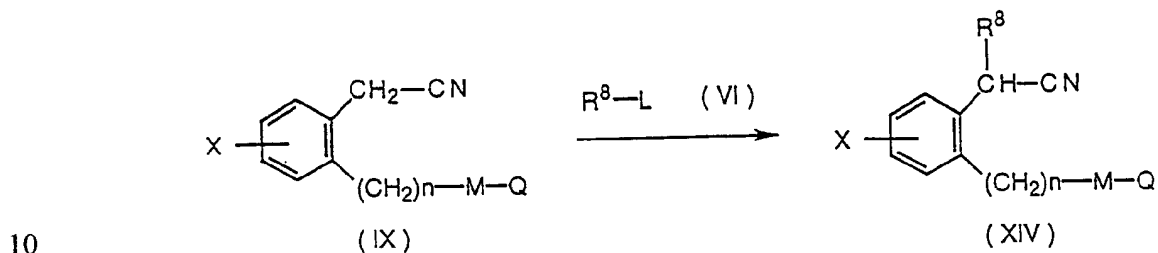
可按照 JP - A 2 - 3651 或 JP - A 2 - 164866 的方法, 卤代相

应的烷苯基化合物制得该反应中用作起始原料的化合物(XXX)。

在方法 H 的反应中用作起始原料的化合物(XIV)优选下述方法 R 制备。

### 方法 R

5



10

其中  $\text{R}^8$  是烷基、卤代烷基或烷氧基烷基，其它符号定义同前。

可使化合物 (IX) 与化合物 (VI) 反应制备化合物 (XIV)。

$\text{R}^8$  表示的基团包括，例如  $\text{R}^1$  代表的上述相应基团。

15 化合物 (VI) 的实例包括：甲基氯、甲基溴、甲基碘、乙基氯、乙基溴、乙基碘、1-碘丙烷、2-碘丙烷、1-碘丁烷、一氯三氟甲烷、1,2-二溴乙烷、氯甲基醚等。化合物 (VI) 的用量的为 1 ~ 5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物 (IX)。

20 该反应通常在碱存在下进行。碱的实例包括：有机碱（如丁基锂、乙醇钠等）和无机碱（如氢氧化钠、氢氧化钾、氨基钠、氢化钠等）。碱的用量为 1 ~ 5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物(IX)。

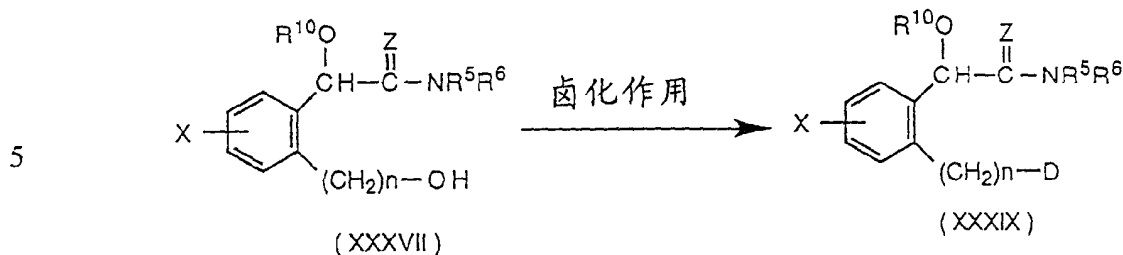
使用的溶剂的实例包括：芳烃，如甲苯、二甲苯等；卤代烃，如二氯甲烷、氯仿等；醚，如乙醚、四氢呋喃等；醇，如甲醇、乙醇等；N,N-二甲基甲酰胺、二甲亚砜等。

25 反应温度从  $-80\text{ }^\circ\text{C}$  至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选  $0\text{ }^\circ\text{C}$  ~  $80\text{ }^\circ\text{C}$ 。反应时间为 0.5 ~ 48 小时，优选 0.5 ~ 6 小时。

由此制得的化合物(XIV)可用已知方法（如色谱法、重结晶法等）分离和提纯。

30 包含于方法 M 的反应中用作起始物料的化合物(XVIII)中的化合物 (XXXIX)，优选按下述方法 S 制备。

## 方法 S



其中  $R^5$  是氢原子或烷基,  $R^6$  是氢原子、烷基或羟烷基,  $R^{10}$  是任意取代的烷基、任意取代的链烯基或任意取代的炔基, 其它符号定义同前。

10 可在适当溶剂中卤代化合物(XXXVII)制备化合物(XXXIX)。

$R^{10}$  表示的烷基、链烯基和炔基包括, 作为  $R^1$  分别表示的上述任意取代羟基的取代基的烷基、链烯基和炔基。

在该反应中使用的卤化剂包括: 例如, 氯化剂, 如亚硫酸氯、磷酸氯、五氯化磷、四氯化碳-三苯基膦等; 和溴化剂, 如亚硫酸溴、磷酸溴、四溴化碳-三苯基膦等。卤化剂的用量为 1 ~ 5 摩尔, 优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物(XXXVII)。

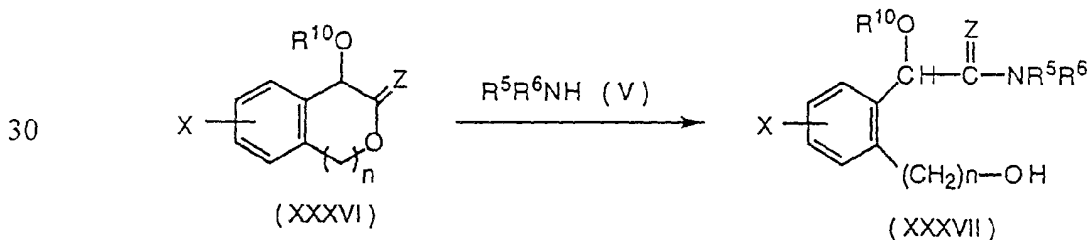
使用的溶剂的实例包括: 芳烃, 如甲苯、二甲苯等; 卤代烃, 如二氯甲烷、氯仿等; 醚, 如乙醚、四氢呋喃等。

20 反应温度从 0 °C 至溶剂的回流温度范围内适当选择, 优选 20 °C ~ 80 °C。反应时间为 0.5 ~ 48 小时, 优选 0.5 ~ 12 小时。

由此制得的化合物(XXXIX), 可以以粗产物、反应混合物形式, 或在用已知方法(如色谱法、重结晶等)分离和提纯后, 在下一步骤中使用。

25 在该反应中用作起始原料的化合物(XXXVII)优选按下述方法 T 制备。

## 方法 T



其中每个符号定义同前。

可在适当溶剂中，使化合物(XXXVI)与化合物 V 反应制备化合物(XXXVII)。

5 化合物(V)的优选实例包括：液氨；伯胺，如甲胺、乙胺等；和仲胺，如二甲胺、二乙胺等。化合物(V)的用量为1~5摩尔，优选1~2摩尔/摩尔化合物(XXXVI)。

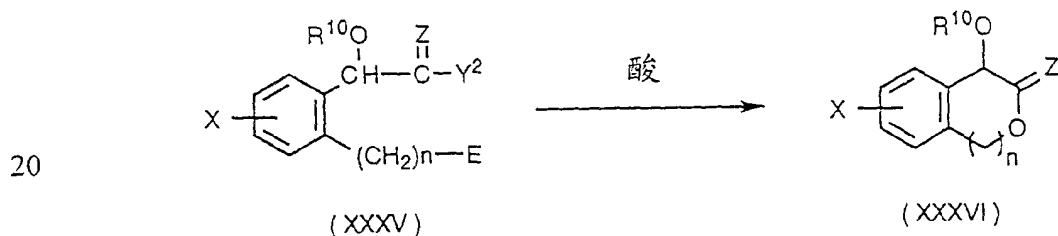
使用的溶剂的实例包括：醇，如甲醇、乙醇等；芳烃，如甲苯、二甲苯等；卤代烃，如二氯甲烷、氯仿等；醚，如乙醚、四氢呋喃等；和水。这些溶剂可以单独使用，或以其混合物形式使用。

10 反应温度从0℃至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选20℃~80℃。反应时间为0.5~48小时，优选0.5~12小时。

由此制得的化合物(XXXVII)可以以反应混合物或粗产物形式，或在用已知方法(如色谱法、重结晶等)分离或提纯后，在下一步骤中使用。

15 在该反应中用作起始原料的化合物(XXXVI)优选按下述方法U制备。

#### 方法U



其中Y<sup>2</sup>是烷氧基、E是被保护的羟基，其余符号定义同前。

可在适当溶剂中用酸处理化合物(XXXV)制备化合物(XXXVI)。

25 在上述结构式中，Y<sup>2</sup>代表的烷氧基包括Y表示的上述烷氧基。

E表示的被保护羟基的保护基团包括羟基的常规保护基团，如醚-型保护基团、乙缩醛-型保护基团等，例如，记载于(参见T. W. Green, "Protective Groups in Organic Synthesis" p. 1 - 113, John Willy & Sons(1981); C. B. Reese, "Protective Groups in Organic Chemistry", J. F. McOmie (ed.), p. 95 - 143, Plenum Press (1973), 等)中。

30

醚-型保护基团的实例包括：烷基（如， $C_1-6$ 烷基，优选 $C_1-4$ 烷基，如甲基、乙基、丙基、叔丁基等），链烯基（如， $C_2-6$ 链烯基，优选 $C_2-4$ 链烯基，如烯丙基等），芳烷基（如，取代或未被取代的 $C_6-10$ 芳基- $C_1-4$ 烷基，如苄基、对-甲氧苄基、三苯甲基等），三烷基甲硅烷基（如，三- $C_1-6$ 烷基甲硅烷基，例如：三异丙基甲硅烷基、叔丁基二甲基甲硅烷基等），烷基二芳基甲硅烷基（如， $C_1-6$ 烷基二- $C_6-10$ 芳基甲硅烷基，如叔丁基二苯基甲硅烷基等），三芳烷基甲硅烷基（如，三苄基甲硅烷基等）等等。

乙缩醛-型保护基团的实例包括：烷氧基烷基（如， $C_1-4$ 烷氧基- $C_1-4$ 烷基，如甲氧基甲基、1-乙氧基乙基、1-甲基-1-甲氧基乙基等）；烷氧基烷氧基烷基（如， $C_1-4$ 烷氧基- $C_1-4$ 烷氧基- $C_1-4$ 烷基，如甲氧基乙氧基甲基等），烷硫基烷基（如， $C_1-4$ 烷硫基- $C_1-4$ 烷基，例如，甲硫基甲基等），四氢吡喃基（如，四氢吡喃-2-基、4-甲氧基四氢吡喃-4-基等），四氢噻喃基（如，四氢噻喃-2-基等），四氢呋喃基（如，四氢呋喃-2-基等），四氢噻吩基（如，四氢噻吩-2-基等），芳烷氧基烷基（如，苄氧基甲基等）等等。

其中，经酸处理可除去的保护基是优选的。四氢吡喃（此时E是四氢吡喃氧基）和1-乙氧基乙基（此时E是1-乙氧基乙氧基）尤为优选，四氢吡喃-2-基（此时E是2-四氢吡喃基氧基）最为优选。

在该反应中使用的酸的实例包括：无机酸，如盐酸、氢溴酸、硝酸、硫酸等；磺酸，如对-甲苯磺酸等；酸-碱对，如对-甲苯磺酸吡啶鎓等，等等。酸的用量为0.01~0.5摩尔，优选0.05~0.2摩尔/摩尔化合物(XXXV)。

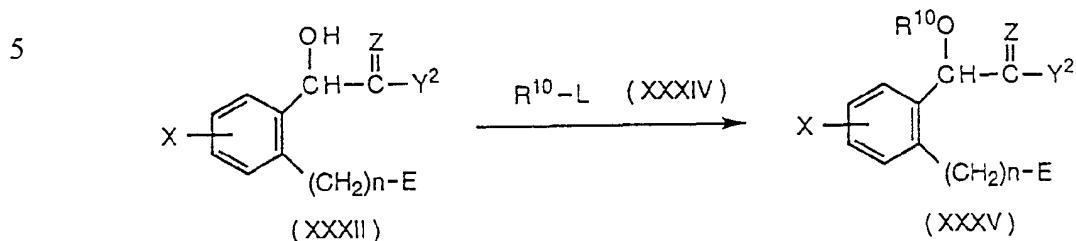
使用的溶剂实例包括：醇，如甲醇、乙醇等；芳烃，如甲苯、二甲苯等；卤代烃，如二氯甲烷、氯仿等；醚，如乙醚、四氢呋喃等；和水。这些溶剂可单独使用或以混合物形式使用。

反应温度从0℃至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选20℃~80℃。反应时间为0.5~48小时，优选0.5~12小时。

由此制得的化合物(XXXVI)可以以反应混合物或粗产物形式，或在用已知方法（如色谱法、重结晶等）分离和提纯后，在下面的步骤中使用。

在该反应中用作起始原料的化合物(XXXV)优选按下述方法 V 制备。

### 方法 V



10 其中 L 是离去基团，其它符号定义同前。

可在碱存在下，于适当溶剂中，使化合物(XXXII)与化合物(XXXIV)反应制备化合物(XXXV)。

在上述结构式中 L 代表的离去基团包括：例如，卤原子（如，氯、溴、碘等），烷基磺酰氧基（如，甲磺酰氧基等），芳磺酰氧基（如，对-甲苯磺酰氧基等）等等。

15

在该反应中使用的化合物(XXXIV)的优选实例包括：烷基卤化物（如甲基氯、甲基溴、甲基碘、乙基氯、乙基溴、乙基碘、1-碘丙烷、2-碘丙烷、1-碘丁烷、-氯三氟甲烷、1,2-二溴乙烷、氯甲基醚等），链烯基卤化物（如，烯丙基溴等），炔基卤化物（如，炔丙基溴等）等等。化合物(XXXIV)的用量为 1 ~ 5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物(XXXII)。

20

碱的实例包括：有机碱（如：醇盐，例如甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾等），无机碱（如，金属氢氧化物，如氢氧化钠、氢氧化钾等；氢化物，如氢化钠、氢化钾等）等等。碱的用量为 1 ~ 5 摩尔，优选 1 ~ 2 摩尔/摩尔化合物(XXXII)。

25

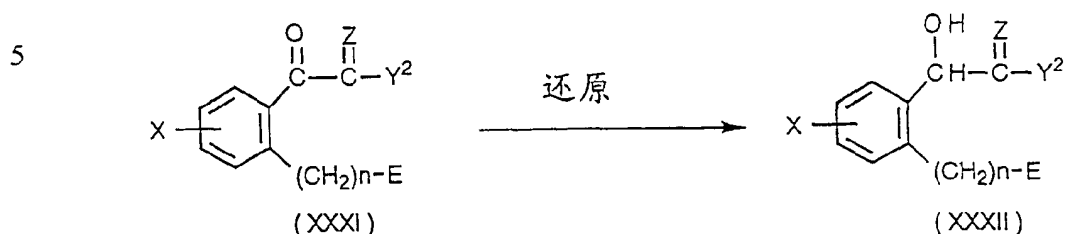
使用的溶剂的实例包括：醚，如乙醚、四氢呋喃等；N,N-二甲基甲酰胺，二甲亚砜、甲苯等。

反应温度从 - 20 °C 至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选 0 °C ~ 50 °C。反应时间为 0.5 ~ 48 小时，优选 0.5 ~ 10 小时。

30 由此制得的化合物(XXXV)可以反应混合物或粗产物形式，或者在用已知方法（如色谱法、重结晶等）分离和提纯后在后面的步骤中使用。

在该反应中用作起始原料的化合物(XXXI)优选按下述方法 W 制备。

### 方法 W



10 其中每个符号的定义同前。

可在适当溶剂中还原化合物(XXXI)制备化合物(XXXII)。

使用的还原剂是还原酮的常规还原剂，例如金属氢化物，金属氢化物配位化合物等。还原剂的实例包括：三-配位甲硼烷（如，甲硼烷等），四-配位硼酸盐（如硼氢化钠、硼氢化锂等），三-配位铝（如：二异丁基铝氢化物等），四-配位 alumininate 配位物（如氢化锂铝等），等等。还原剂的用量为 0.25 ~ 3 摩尔，优选 1.0 ~ 1.2 摩尔/摩尔化合物(XXXI)。

15

溶剂的实例包括：醇，如甲醇、乙醇等；醚，如乙醚、四氢呋喃等；水等等。这些溶剂可单独使用或以混合物形式使用。

20 反应温度从 - 20 °C 至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选 0 °C ~ 50 °C。反应时间为 0.5 ~ 24 小时，优选 0.5 ~ 2 小时。

由此制得的化合物(XXXII)可以以反应混合物或粗产物形式，或用已知方法（如色谱法、重结晶等）分离和提纯后，在下面的步骤中使用。

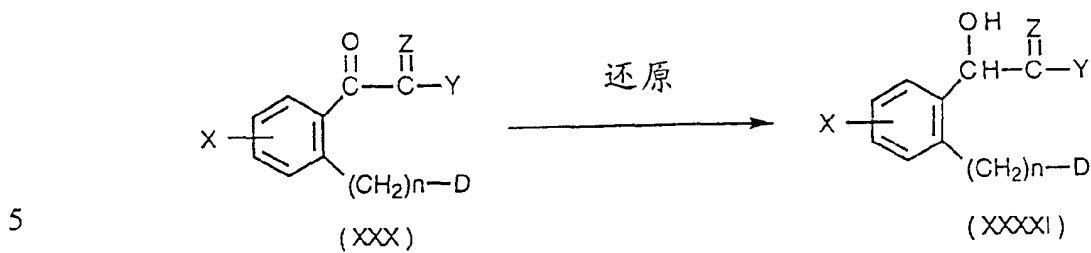
可按照 Journal of Organic Chemistry, USSR, Vol. 5, p. 1530 (1969)的方法，使 2 - (取代甲基) - 1 - 溴苯的 Grignard 化合物与草酸二烷基酯反应，制备在该反应中作为起始原料的化合物(XXXI)。

25

包含于可用作方法 M 的起始原料的化合物(XVIII)中的化合物(XXXXI)，可按下述方法 X 制备。

### 方法 X

30



其中每个符号定义同前。

可在适当溶剂中还原化合物(XXX)制备化合物(XXXXI)。

10 使用的还原剂是还原酮的常规还原剂，例如金属氢化物、金属氢化物配合物等。还原剂的实例包括：三-配位甲硼烷（如甲硼烷等），四-配位硼酸盐（如：硼氢化钠、硼氢化锂等），三-配位铝（如：二异丁基铝氢化物等），四-配位alumininate配合物（如，氢化铝锂等）等等。还原剂的用量为 0.25 ~ 3 摩尔，优选 1.0 ~ 1.2 摩尔/摩尔化合物(XXX)。

15 溶剂的实例包括：醇，如甲醇、乙醇等；醚，如，乙醚、四氢呋喃等；水等等。这些溶剂可单独使用或以混合物形式使用。

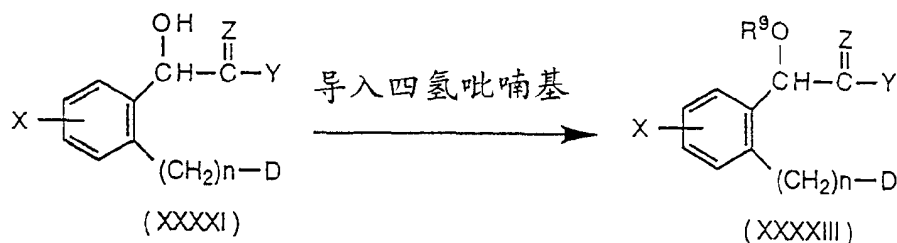
反应温度从 - 20 °C 至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选 0 ~ 50 °C。反应时间为 0.5 ~ 24 小时，优选 0.5 ~ 2 小时。

20 由此制得的化合物(XXXXI)可以以反应混合物形式或粗产物形式，或在按已知方法（如：色谱法、重结晶等）分离和提纯后，在下面的步骤中使用。

包含于可用作方法 M 中起始原料的化合物(XVIII)中的化合物(XXXXIII)，可优选按下述方法 Y 制备。

#### 方法 Y

25



30

其中 R<sup>9</sup> 是四氢吡喃基，其它符号定义同前。

可将四氢吡喃基导入化合物(XXXXI)制备化合物(XXXXIII)。

$R^9$  代表的四氢吡喃基包括, 例如, 2-四氢吡喃基等。

可用使用四氢吡喃基保护羟基的常规方法导入四氢吡喃基, 例如可在适当溶剂中, 于酸存在下, 使化合物(XXXXI)与二氢吡喃反应。

酸的实例包括对-甲苯磺酸、盐酸、磷酰氯、酸-碱对, 如对-甲苯磺酸吡啶鎓等。酸的用量为 0.01 ~ 0.5 摩尔, 优选 0.05 ~ 0.2 摩尔/摩尔化合物(XXXXI)。

使用的溶剂的实例包括: 芳烃, 如甲苯、二甲苯等; 卤代烃, 如二氯甲烷、氯仿等; 醚, 如乙醚、四氢呋喃等。这些溶剂可单独使用或以混合物形式使用。

10. 反应温度从 0 °C 至溶剂的回流温度范围内适当选择, 优选 20 °C ~ 80 °C。反应时间为 0.5 ~ 48 小时, 优选 0.5 ~ 12 小时。

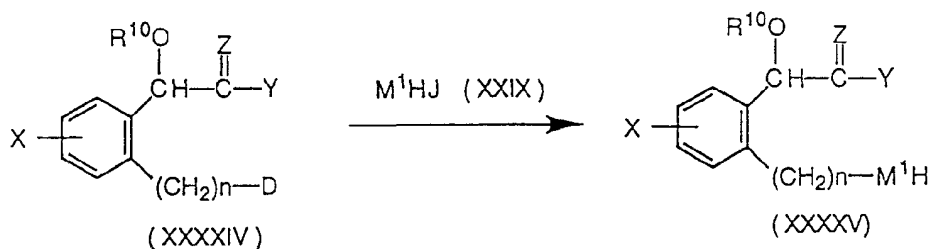
由此制得的化合物(XXXXIII)可以以反应混合物或粗产物形式, 或在用已知方法(如色谱法、重结晶等)分离和提纯后, 在下面的步骤中使用。

15. 可在该反应中用作起始原料的化合物(XXXXI)优选按前述方法 X 制备。

包含于方法 N 中, 用作起始原料的化合物(XXIII)中的化合物(XXXXV)可按下述方法 Z 制备。

#### 方法 Z

20



25

其中  $R^{10}$  是任意取代的烷基、任意取代的链烯基或任意取代的炔基, D 是卤原子,  $M^1$  是硫原子或  $NR^2$  ( $R^2$  是氢原子、烷基或酰基), 其它符号定义同前。

使化合物(XXXXIV)与化合物(XXIX)反应制备化合物(XXXXV)。

30. 化合物(XXIX)可以是金属盐的形式。金属盐的实例包括: 碱金属盐(钠盐、钾盐等), 碱土金属盐(镁盐、钙盐等)等等。

当硫醇为硫化氢的金属盐（如，氢硫化钠、氢硫化钾）被用作化合物(XXIX)时，其用量为1~5摩尔，优选1~2摩尔/摩尔化合物(XXXXIV)。

溶剂的实例包括：醇，例如甲醇、乙醇等；卤代烃，例如二氯甲烷、1,2 - 二氯乙烷等；醚，例如乙醚等；芳烃，如甲苯等；二甲亚砜、N,N - 二甲基甲酰胺等。反应温度从0℃至溶剂的回流温度范围内适当选择，  
5 优选室温至溶剂的回流温度。反应时间为0.5 ~ 24小时，优选1 ~ 5小时。

当胺或胺的金属盐（如，氨基钠等）被用作化合物(XXIX)时，其用量1 ~ 5摩尔，优选1 ~ 2摩尔/摩尔化合物(XXXXIV)。溶剂的实例包  
10 括：醇，如甲醇、乙醇等；卤代烃，如二氯甲烷、1,2 - 二氯乙烷等；醚，如乙醚等；芳烃，如甲苯等；二甲亚砜、N,N - 二甲基甲酰胺等。

反应温度从0℃至溶剂的回流温度范围内适当选择，优选0℃至室温。反应时间0.5 ~ 24小时，优选1 ~ 5小时。

由此制得的化合物(XXXXV)可以以反应混合物或粗产物的形式，或在按已知方法（如色谱法、重结晶等）分离和提纯后，在下面的步骤中  
15 使用。

本发明的式(I)化合物对于农作物（如：水稻、小麦、大麦、黑麦、玉米、普通小米（common millet）、黍、荞麦、大豆、赤豆、花生等），果树（如：柑桔、葡萄、苹果、梨、桃等），蔬菜（如：黄瓜、  
20 茄子、蕃茄、南瓜、菜豆、等）等，或其种籽的广谱植物病原体真菌均有效果。对于土壤中的植物病原体真菌也有效。本发明化合物对于蔬菜、葡萄等的 *Pyricularia oryzae*、茄属丝核菌（*Rhizoctonia solani*）、麦类白粉菌（*Erysiphe graminis*）、苍耳单丝壳菌（*Sphaerotheca fuliginea*）、二孢白粉菌（*Erysiphe cichoracearum*）、*Phylophthora infestans*、古巴假霜霉（*Pseudoperonospora cubensis*）、东北霜霉（*Peronospora manshurica*）、*Plasaopara viticola*、灰绿葡萄孢（*Botrytis cinerea*）、对于荞麦、大豆、欧洲油菜等的瓜果腐霉（*Pythium aphanidermatum*）、油菜核盘菌（*Sclerotinia sclerotiorum*），对于大豆、赤豆、马铃薯、花生等的花生烟草白绢病菌（*Corticium rolfsii*），对  
30 于 *Pseudocercospora herpotrichoides*、禾冠柄锈菌（*Puccinia coronata*）等表现出特别强的杀菌活性。因此，本发明化合物(I)被用作农业杀菌剂。

可用任何常规的方法，如喷雾、散射或喷撒活性化合物，向植物施用本发明的化合物（I）。也可通过用活性化合物处理植物的种籽、生长植物的土壤，播种的土壤，稻田或灌溉用水来进行施用。可在植物病原体真菌对植物侵害前或侵害后进行施用。

- 5 该化合物可以以适用于农用杀菌剂的常用制剂形式，如溶液、可湿性粉末、乳液、悬浮液、浓缩液体制剂、片剂、胶囊、烟雾剂、粉末、糊剂、粉剂等形式使用。

- 可用常规方法，将至少一种本发明化合物与适当的固体或液体载体和，如果需要，改进活性化合物的分散性和其它性能的适当辅剂（如：表面活性剂、铺展剂、分散剂、稳定剂等）相混合，制得这样的制剂形式。

- 10 固体载体或稀释剂的实例包括：植物材料（如，面粉、烟杆末、大豆粉、胡桃壳粉、蔬菜粉、锯末、糠、树皮粉、纤维素粉、蔬菜提取物残渣等），纤维材料（如：纸、波纹纸板、旧石板瓦等），人工塑料粉末、粘土（如，高岭土，膨润土、硅藻土等），滑石，其它无机材料（如，
- 15 叶蜡石、绢云母、浮石、硫磺粉、活性碳等），化肥（如：硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、尿素、氯化铵等）等等。

- 液体载体或稀释剂的实例包括：水、醇（如，甲醇、乙醇等），酮（如丙酮、甲乙酮等），醚（如乙醚、二恶烷、溶纤剂、四氢呋喃等），芳烃（如苯、甲苯、二甲苯、甲基萘等），脂族烃（如，汽油、煤油、
- 20 灯油等），酯，腈、酰胺（如：二甲基甲酰胺、二甲基乙酰胺等），卤代烃（如，二氯乙烷、四氯化碳等）等等。

表面活性剂的实例包括：烷基硫酸盐、烷基磺酸盐、烷芳基磺酸盐、聚乙二醇醚、多羟基醇酯等。

- 铺展剂或分散剂的实例包括：酪蛋白、明胶、淀粉、羧甲基纤维素、
- 25 阿拉伯树胶、藻酸、木质素、膨润土、糖浆、聚乙烯基醇、松油、琼脂等。

稳定剂的实例包括：PAP（异丙基磷酸酯的混合物）、磷酸三甲苯酯（TCP）、妥卢油、环氧化的油、表面活性剂、脂肪酸及其酯。

- 除上述组份外，本发明的组合物还可以含有其它杀菌剂、杀虫剂、
- 30 除草剂或肥料。

上述组合物通常含有至少一种本发明式（I）化合物，其浓度为1~95wt%，优选2.0~80wt%。可以直接使用该组合物，或者以其稀释形

式使用。本发明化合物通常以约 1 ~ 50,000 ppm, 优选以 100 ~ 5,000 ppm 的浓度施用, (用量) 约 1.0g 至 5kg/公顷, 优选的约 2g 至 100g/公顷。

### 实施例

下述的实施例和试验例是对本发明的进一步的具体说明而非对其范围的限制。偶合常数 (J) 的单位是赫兹 (Hz)。

#### 实施例 1

2-羟基-2-(2-苯氧基苯基)乙酰胺(化合物序号 2)的合成  
将 2-氧代-2-(2-苯氧基苯基)乙酰胺 (4.82g, 20.0mmol) 溶于乙醇中 (50ml)。冰冷下缓慢加入硼氢化钠 (0.76g, 20.0mmol)。搅拌 30 分钟后, 用 1N 盐酸中和该混合物, 用乙酸乙酯萃取。有机相用饱和盐水洗涤, 硫酸钠干燥, 蒸去溶剂得到一油状物。用硅胶柱色谱(正己烷-乙酸乙酯洗脱)提纯, 得到无色晶体状所需化合物 2-羟基-2-(2-苯氧基苯基)乙酰胺 (4.3g, 89%)。用正己烷-二氯甲烷的混合溶剂将该化合物重结晶, 得到无色结晶。

15

mp.: 121-122°C

NMR ( $\delta$  ppm TMS/CDCl<sub>3</sub>): 4.11(1H,brs), 5.46(1H,s),

5.57(1H,brs), 6.58(1H,brs), 6.88(1H,dd,J=7.9,1.2), 7.03

(2H,dd,J=7.9,1.2), 7.13-7.20(2H,m), 7.23-7.27(1H,m), 7.29-

20

7.40(2H,m), 7.58(1H,dd,J=7.9,1.2).

#### 实施例 2

2-[2-(2,5-二甲基苯氧基甲基)苯基]-2-羟基-N-甲基乙酰胺(化合物序号 75)的合成

25

将 2-[2-(2,5-二甲基苯氧基甲基)苯基]-N-甲基-2-氧代乙酰胺 (0.93g, 3.1mmol) 溶于甲醇 (10ml) 中。冰冷下缓慢加入硼氢化钠 (0.06g, 1.6mmol)。搅拌 30 分钟后, 用 1N 盐酸中和该混合物并用乙酸乙酯萃取。有机相用饱和盐水洗涤并用硫酸钠干燥, 蒸去溶剂得到一油状物。用硅胶柱色谱(正己烷-乙酸乙酯洗脱)提纯该油状物, 得到白色晶状所需化合物 2-[2-(2,5-二甲基苯氧基甲基)苯基]-2-羟基-N-甲基乙酰胺 (0.85g, 91%)。

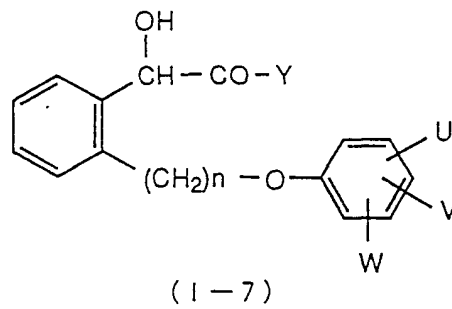
30

mp.: 86-87°C

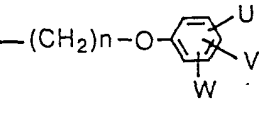
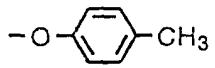



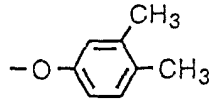
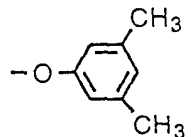
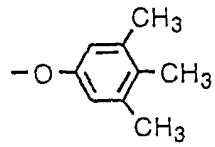
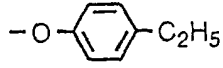
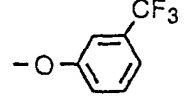
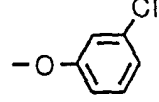
NMR ( $\delta$  ppm TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 2.16(3H,s), 2.35(3H,s),  
2.78(3H,d,J=4.9), 4.35(1H,d,J=3.7), 4.94(1H,d,J=11.0),  
5  
5.34(1H,d,J=11.0), 5.35(1H,d,J=3.7), 6.49(1H,brs), 6.78  
(1H,d,J=7.3), 6.87(1H,s), 7.06(1H,d,J=7.3), 7.32-7.48(4H,m).

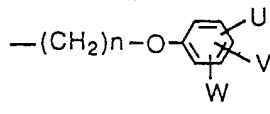
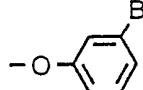
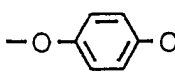
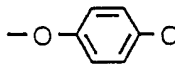
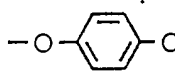
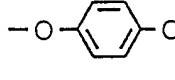
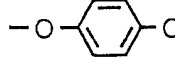
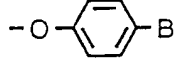
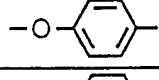
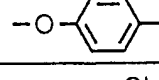
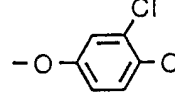
### 实施例 3

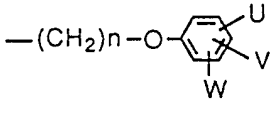
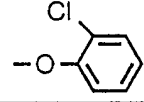
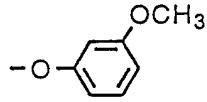
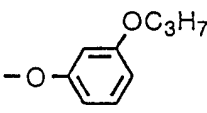
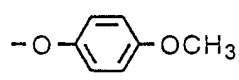
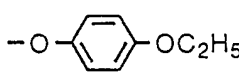
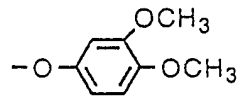
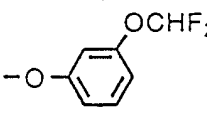
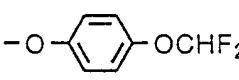
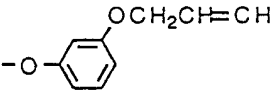
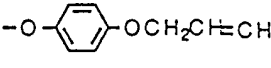
按照与实施例 1 或 2 中所述相同的方法, 合成式 (I-7) 化合物。  
10 由此制得的化合物及其代表性化合物的物理数据列于下述表中。

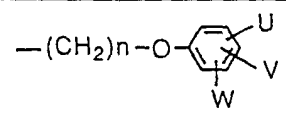
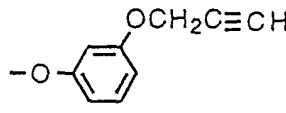
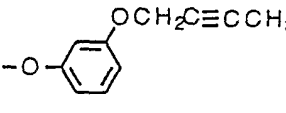
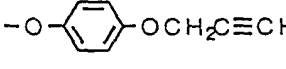
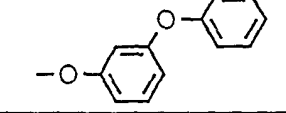
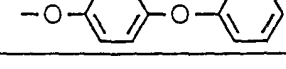
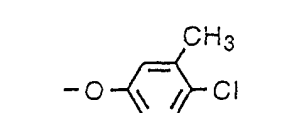
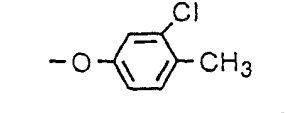
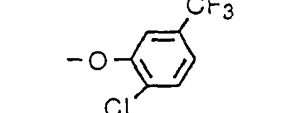
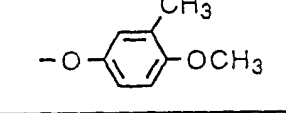
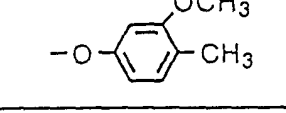


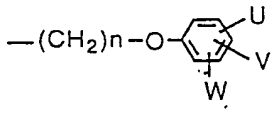
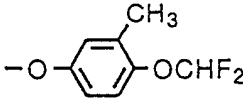
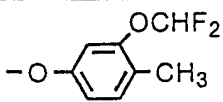
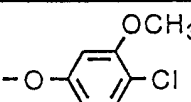
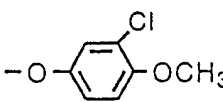
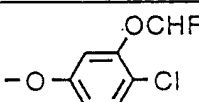
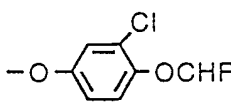
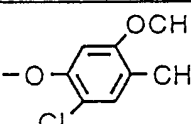
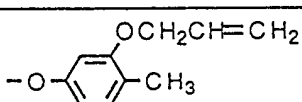
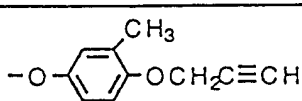
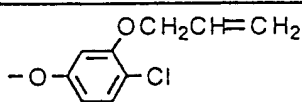
化合物 序号		Y	特性	mp 或 <sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
1		NHCH <sub>3</sub>	晶体	99.0~99.5 °C
2		NH <sub>2</sub>	晶体	121~122 °C
3		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	晶体	127~128 °C
4		NHCH <sub>2</sub> OH	晶体	94.5~95.5 °C
5		NHCH <sub>3</sub>		
6		NH <sub>2</sub>		
7		NHCH <sub>3</sub>	油状物	2.34(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 4.20(1H, br), 5.40(1H, s), 6.4(1H, brs), 6.80-6.88(3H, m), 6.96(1H, d, J=7.3), 7.13-7.28(3H, m), 7.55(1H, dd, J=7.3, 1.8).
8		NHCH <sub>2</sub> OH		
9		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		
10		NH <sub>2</sub>		

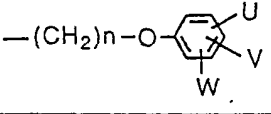
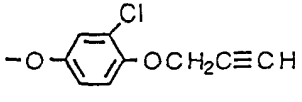
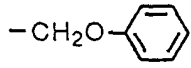
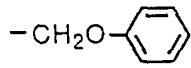
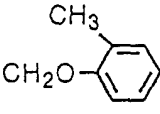
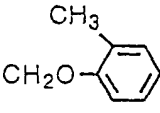
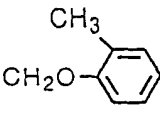
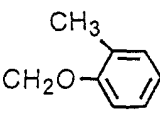
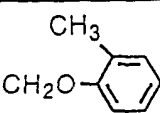
化合物 序号	$-(CH_2)_n-O-$ 	Y	特性	mp 或 $^1H-NMR(CDCl_3)$ $\delta$ ppm
1 1		$NHCH_3$	晶体	79 ~ 82 °C
1 2		$NHCH_2OH$		
1 3		$N(CH_3)_2$		
1 4		$NHC_2H_5$		
1 5		$NHCH_3$	油状物	2.25(6H,s), 2.84(3H,d, J=4.9), 5.43(1H,s), 6.58(1H, brs), 6.74(1H, dd, J=7.3, 1.2), 6.81(1H, s), 6.83(1H, d, J=7.3), 7.11(1H, d, J=7.3), 7.13(1H, dt, J=1.2, 7.3), 7.22(1H, dt, J=1.8, 7.3), 7.54(1H, dd, J=7.3, 1.8).
1 6		$NHCH_3$	晶体	119 ~ 120 °C
1 7		$NHCH_3$		
1 8		$NHCH_3$		
1 9		$NHCH_3$		
2 0		$NHCH_3$		

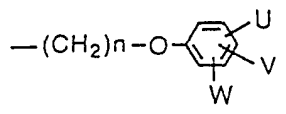
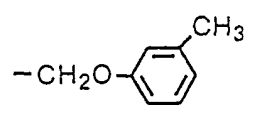
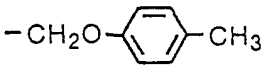
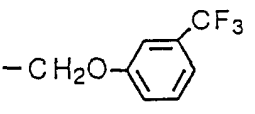
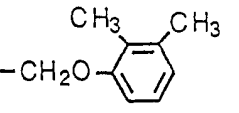
化合物 序号	$-(\text{CH}_2)_n-\text{O}-$ 	Y	特性	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm}$
2 1		$\text{NHCH}_3$		
2 2		$\text{NH}_2$		
2 3		$\text{NHCH}_3$	油状物	2.83(3H, d, $J=4.9$ ), 4.20 (1H, brs), 5.36(1H, s), 6.41(1H, brs), 6.84(1H, d, $J=6.7$ ), 6.93-6.98(2H, m), 7.16-7.33(4H, m), 7.53(1H, dd, $J=7.3, 1.8$ ).
2 4		$\text{NHCH}_2\text{OH}$		
2 5		$\text{N}(\text{CH}_3)_2$		
2 6		$\text{NHC}_2\text{H}_5$		
2 7		$\text{NHCH}_3$		
2 8		$\text{NHCH}_3$		
2 9		$\text{NHCH}_3$		
3 0		$\text{NHCH}_3$		

化合物 序号	$-(\text{CH}_2)_n-\text{O}-$ 	Y	特性	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm}$
3 1		$\text{NHCH}_3$		
3 2		$\text{NHCH}_3$		
3 3		$\text{NHCH}_3$		
3 4		$\text{NHCH}_3$		
3 5		$\text{NHCH}_3$		
3 6		$\text{NHCH}_3$		
3 7		$\text{NHCH}_3$		
3 8		$\text{NHCH}_3$		
3 9		$\text{NHCH}_3$		
4 0		$\text{NHCH}_3$		

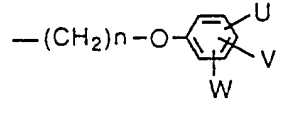
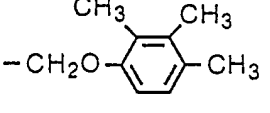
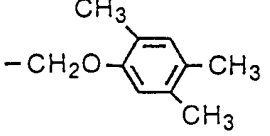
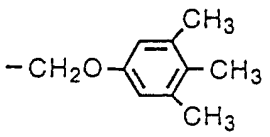
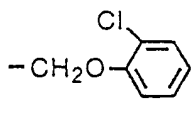
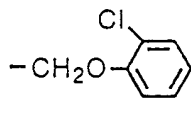
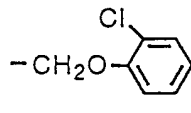
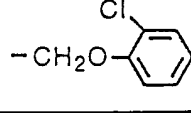
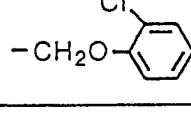
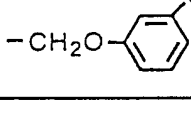
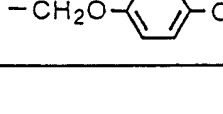
化合物 序号	$-(\text{CH}_2)_n-\text{O}-$ 	Y	特性	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm}$
4 1		$\text{NHCH}_3$		
4 2		$\text{NHCH}_3$		
4 3		$\text{NHCH}_3$		
4 4		$\text{NHCH}_3$		
4 5		$\text{NHCH}_3$		
4 6		$\text{NHCH}_3$	油状物	2.34(3H, s), 2.83(3H, d, J = 4.9), 4.20(1H, brs), 5.36(1H, s), 6.41(1H, brs), 6.76-6.90(3H, m), 7.17-7.31 (3H, m), 7.56(1H, dd, J=7.3, 1.8).
4 7		$\text{NHCH}_3$		
4 8		$\text{NHCH}_3$		
4 9		$\text{NHCH}_3$		
5 0		$\text{NHCH}_3$		

化合物 序号		Y	特性	mp 或 <sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
5 1		NHCH <sub>3</sub>		
5 2		NHCH <sub>3</sub>		
5 3		NHCH <sub>3</sub>		
5 4		NHCH <sub>3</sub>		
5 5		NHCH <sub>3</sub>		
5 6		NHCH <sub>3</sub>		
5 7		NHCH <sub>3</sub>		
5 8		NHCH <sub>3</sub>		
5 9		NHCH <sub>3</sub>		
6 0		NHCH <sub>3</sub>		

化合物 序号	$-(\text{CH}_2)_n-\text{O}-$ 	Y	特性	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm}$
6 1		$\text{NHCH}_3$		
6 2	$-\text{CH}_2\text{O}-$ 	$\text{NH}_2$		
6 3	$-\text{CH}_2\text{O}-$ 	$\text{NHCH}_3$	油状物	2.81(3H, d, J=4.9), 5.02(1H, d, J=11.0), 5.26(1H, s), 5.30 (1H, d, J=11.0), 6.73(1H, brs), 6.97(2H, d, J=7.9), 7.05 (1H, t, J=7.3), 7.31-7.50 (6H, m)
6 4		$\text{NHCH}_3$	晶体	104.6~105.7 °C
6 5		$\text{NH}_2$		
6 6		$\text{NHCH}_2\text{OH}$		
6 7		$\text{N}(\text{CH}_3)_2$		
6 8		$\text{NHC}_2\text{H}_5$		

化合物 序号	$-(\text{CH}_2)_n-\text{O}-$ 	Y	特性	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm}$
69	$-\text{CH}_2\text{O}-$ 	$\text{NHCH}_3$	油状物	2.36(3H, s), 2.75(3H, d, $J=4.8$ ), 4.55(1H, brs), 4.97(1H, d, $J=11.0$ ), 5.20(1H, s), 5.21(1H, d, $J=11.0$ ), 6.73-6.84(4H, m), 7.19(1H, t, $J=7.6$ ), 7.28-7.44(4H, m)
70	$-\text{CH}_2\text{O}-$ 	$\text{NHCH}_3$	油状物	2.30(3H, s), 2.77(3H, d, $J=4.8$ ), 4.55(1H, m), 4.97(1H, d, $J=11.0$ ), 5.23(1H, s), 5.24(1H, d, $J=11.0$ ), 6.83(1H, brs), 6.85(2H, d, $J=8.8$ ), 7.13(2H, d, $J=8.8$ ), 7.29-7.48(4H, m)
71	$-\text{CH}_2\text{O}-$ 	$\text{NHCH}_3$	油状物	2.76(3H, d, $J=4.8$ ), 4.60(1H, brs), 5.11(1H, d, $J=11.0$ ), 5.12(1H, s), 5.16(1H, d, $J=11.0$ ), 6.61(1H, brs), 7.09-7.18(2H, m), 7.27-7.44(6H, m)
72	$-\text{CH}_2\text{O}-$ 	$\text{NHCH}_3$		

化合物 序号		Y	特性	mp 或 <sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
73		NHCH <sub>3</sub>		
74		NH <sub>2</sub>	油状物	2.12(3H,s),2.33(3H,s),4.40(1H, d, J=4.3), 4.93(1H, d, J=11.0), 5.27(1H, d, J=11.0), 5.34(1H, d, J=4.3), 6.06(1H, brs), 6.63(1H, brs), 6.75(1H, d, J=7.3), 6.83(1H, s), 7.03(1H, d, J=7.9), 7.29-7.47(4H, m).
75		NHCH <sub>3</sub>	晶体	86~87 °C
76		NHCH <sub>2</sub> OH		
77		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	晶体	144~145 °C
78		NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	油状物	0.99(3H, d, J=7.3), 2.17(3H, s), 2.32(3H, s), 3.13-3.27(2H, m), 4.45(1H, d, J=4.3), 4.96(1H, d, J=11.6), 5.24(1H, d, J=11.6), 5.28(1H, d, J=4.3), 6.62(1H, brs).
79		NHCH <sub>3</sub>		
80		NHCH <sub>3</sub>		

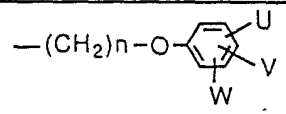
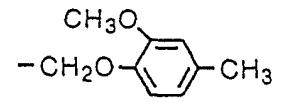
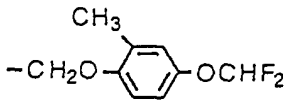
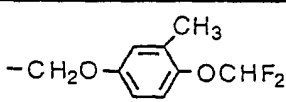
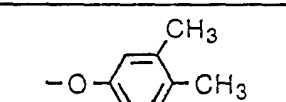
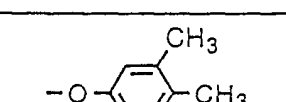
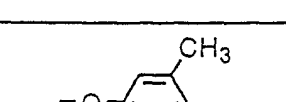
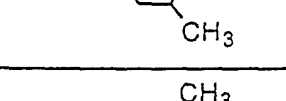
化合物 序号	$-(\text{CH}_2)_n-\text{O}-$ 	Y	特性	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm}$
8 1		$\text{NHCH}_3$		
8 2		$\text{NHCH}_3$		
8 3		$\text{NHCH}_3$		
8 4		$\text{NH}_2$		
8 5		$\text{NHCH}_3$	油状物	2.80(3H, d, J=4.9), 4.99(1H, d, J=10.4), 5.28(1H, s), 5.42(1H, d, J=10.4), 6.62(1H, brs), 7.00(1H, t, J=7.3), 7.16(1H, d, J=7.9), 7.28-7.50(6H, m)
8 6		$\text{NHCH}_2\text{OH}$		
8 7		$\text{N}(\text{CH}_3)_2$		
8 8		$\text{NHC}_2\text{H}_5$		
8 9		$\text{NHCH}_3$		
9 0		$\text{NH}_2$		

化合物 序号		Y	特性	mp 或 <sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
9 1		NHCH <sub>3</sub>	晶体	6 8 ~ 7 0 °C
9 2		NHCH <sub>2</sub> OH		
9 3		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>		
9 4		NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		
9 5		NHCH <sub>3</sub>		
9 6		NHCH <sub>3</sub>		
9 7		NHCH <sub>3</sub>		
9 8		NHCH <sub>3</sub>		
9 9		NHCH <sub>3</sub>	油状物	2.80(3H, d, J=4.9), 5.00(1H, d, J=11.0), 5.26(1H, s), 5.38(1H, d, J=11.0), 6.50(1H, brs), 7.07(1H, d, J=8.5), 7.25- 7.29(1H, m), 7.31-7.50 (5H, m)
1 0 0		NHCH <sub>3</sub>		

化合物 序号		Y	特性	mp 或 <sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
101		NHCH <sub>3</sub>		
102		NHCH <sub>3</sub>		
103		NHCH <sub>3</sub>		
104		NHCH <sub>3</sub>	油状物	2.76(3H, d, J=4.8), 3.76(3H, s), 4.50(1H, brs), 4.95(1H, d, J=11.0), 5.19(1H, d, J=11.0) 5.24(1H, s), 6.83-6.88(5H, m), 7.30-7.43(4H, m)
105		NHCH <sub>3</sub>		
106		NHCH <sub>3</sub>		
107		NHCH <sub>3</sub>		
108		NHCH <sub>3</sub>		
109		NHCH <sub>3</sub>		
110		NHCH <sub>3</sub>		

化合物 序号		Y	特性	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm}$
111		$\text{NHCH}_3$		
112		$\text{NH}_2$	晶体	151~152℃
113		$\text{NHCH}_3$	晶体	142~143℃
114		$\text{NHCH}_2\text{OH}$		
115		$\text{N}(\text{CH}_3)_2$	晶体	125~127℃
116		$\text{NHC}_2\text{H}_5$	油状物	0.99-1.17(3H in total), 2.19(3H, s), 3.15-3.31( 共 2H), 4.48(1H, br), 5.02(1H, d, J = 11.8), 5.18 (1H, d, J=11.6), 5.21(1H, s), 6.61(1H, brs), 6.83(1H, d, J = 8.5), 7.08(1H, d, J = 8.5), 7.12(1H, s), 7.31- 7.43(4H, m).
117		$\text{NHCH}_3$		
118		$\text{NHCH}_3$		
119		$\text{NHCH}_3$		

化合物 序号		Y	特性	mp, 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm}$
120		NHCH <sub>3</sub>		
121		NHCH <sub>3</sub>		
122		NHCH <sub>3</sub>		
123		NHCH <sub>3</sub>		
124		NHCH <sub>3</sub>		
125		NHCH <sub>3</sub>		
126		NHCH <sub>3</sub>		
127		NHCH <sub>3</sub>		
128		NHCH <sub>3</sub>		
129		NHCH <sub>3</sub>		
130		NHCH <sub>3</sub>		

化合物 序号	$-(\text{CH}_2)_n-\text{O}-$ 	Y	特性	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta \text{ ppm}$
131		$\text{NHCH}_3$		
132		$\text{NHCH}_3$		
133		$\text{NHCH}_3$		
134		$\text{NH}_2$		
135		$\text{NHCH}_2\text{OH}$		
136		$\text{NH}_2$		
137		$\text{NHCH}_2\text{OH}$		

#### 实施例 4

2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 甲氧基乙酸甲酯 ( 化合物序号 139 ) 的合成

于 0 °C 搅拌下, 将 60 % 的油状氢化钠 ( 0.13g, 3.3mmol ) 加至  
 5 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 羟基乙酸甲酯 ( 0.72g, 2.4mmol ) 和甲基碘 ( 0.68g, 4.8mmol ) 的 N,N - 二甲基甲酰胺 ( 6ml ) 溶液中。30 分钟后, 依次加入冰和水, 用乙酸乙酯萃取该混合物, 依次用水和饱和盐水洗涤, 无水硫酸钠干燥。蒸去溶剂, 用硅胶柱色谱 ( 正己烷/乙酸乙酯 = 9/1 ) 提纯残余物, 得到油状所需化合物 2 - [ 2 - ( 2,5  
 10 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 羟基 - N - 乙酸甲酯 ( 0.69g, 92% ) 。

NMR (  $\delta$  ppm, TMS/CDCl<sub>3</sub> ): 2.21 (3H, s), 2.33 (3H, s),  
 3.40 (3H, s), 3.70 (3H, s), 5.10 (1H, d, J=12.2), 5.14 (1H, s), 5.28  
 15 (1H, d, J=12.2), 6.71 (1H, d, J=7.3), 6.76 (1H, s),  
 7.04 (1H, d, J=7.3), 7.33-7.40 (2H, m), 7.50-7.56 (2H, m) .

#### 实施例 5

2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 甲氧基 - N -  
 20 甲基乙酰胺 ( 化合物序号 140 ) 的合成

在室温下, 搅拌 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 甲氧基乙酸甲酯 ( 0.44g, 1.40mmol ) 的甲醇 ( 5ml ) 溶液。向其中加入 40 % 甲胺/甲醇溶液 ( 0.33g, 4.2mmol )。22 小时后减压浓缩该混合物, 残留物用硅胶柱色谱 ( 正己烷/乙酸乙酯 = 2/1 ) 提纯, 得到所  
 25 需的 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 甲氧基 - N - 甲基乙酰胺白色结晶 ( 0.36g, 82 % ) 。

mp. : 86-88°C

NMR (  $\delta$  ppm, TMS/CDCl<sub>3</sub> ): 2.19 (3H, s), 2.32 (3H, s),  
 30 2.83 (3H, d, J=4.9), 3.36 (3H, s), 5.04 (1H, s), 5.07 (1H, d, J=11.6),  
 5.47 (1H, d, J=11.6), 6.70 (1H, d, J=7.3), 6.79 (1H, brs),

6.79(1H,s), 7.03(1H,d,J=7.9), 7.33-7.43(3H,m), 7.49-  
7.54(1H,m).

### 实施例 6

2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 甲氧基 - N -  
5 甲基硫代乙酰胺 ( 化合物序号 170 ) 的合成

将 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 甲氧基 - N -  
- 甲基乙酰胺 ( 0.12g, 0.38mmol ) 和 Lawesson 试剂 ( 0.14g, 0.35mmol )  
在甲苯 ( 5ml ) 中的溶液, 于 80 °C 搅拌加热 2 小时。将该混合物冷至室  
温, 硅胶柱色谱 ( 正己烷 / 乙酸乙酯 = 4/1 ) 提纯, 得到所需化合物 2  
10 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 甲氧基 - N - 甲基  
硫代乙酰胺油状物 ( 0.13g, 100 % )。

NMR ( $\delta$  ppm TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 2.20(3H,s), 2.32(3H,s), 3.23  
(3H,d,J=4.8), 3.35(3H,s), 5.12(1H,d,J=11.6), 5.40(1H,s), 5.58  
15 (1H,d,J=11.6), 6.70(1H,d,J=7.3), 6.81(1H,s),  
7.03(1H,d,J=7.3), 7.28-7.38(3H,m), 7.48-7.52(1H,m),  
8.78(1H,brs).

### 实施例 7

2 - 乙酰氧基 - 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2  
20 - N - 甲基乙酰胺 ( 化合物序号 144 ) 的合成

将 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 羟基 - N -  
- 甲基乙酰胺 ( 0.57g, 1.9mmol ) 和乙酰 ( 0.43g, 4.2mmol ) 在吡啶  
( 3ml ) 中的溶液, 于室温下搅拌 8 小时, 然后减压浓缩。残余物用硅  
胶柱色谱 ( 正己烷 / 乙酸乙酯 = 1/1 ) 提纯, 得到所需化合物 2 - 乙酰氧基  
25 - 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - N - 甲基乙酰胺无  
色晶体 ( 0.53g, 82 % )。

mp.: 114 - 115 °C

NMR ( $\delta$  ppm TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 2.18(3H,s), 2.19(3H,s), 2.34  
30 (3H,s), 2.76(3H,d,J=4.9), 5.02(1H,d,J=11.6), 5.45  
(1H,d,J=11.6), 6.19(1H,brs), 6.35(1H,s), 6.75(1H,d,J=7.3),  
6.85(1H,s), 7.05(1H,d,J=7.3), 7.36-7.58(4H,m).

### 实施例 8

2 - 氯 - 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] 乙酸甲酯 ( 化合物序号 149 ) 的合成

将 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 羟基乙酸甲酯 ( 0.50g, 1.6mmol ) 的 1,2 - 二氯乙烷 ( 20ml ) 溶液于室温下搅拌。向其中加入亚硫酸氯 ( 0.61g, 5.1mmol ), 将该混合物于回流下加热过夜, 减压浓缩。残余物用硅胶柱色谱 ( 正己烷/乙酸乙酯 = 97/3 ) 提纯, 得到所需化合物 2 - 氯 - 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] 乙酸甲酯油状物 ( 0.35g, 66 % )。

10 NMR ( $\delta$  ppm TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 2.20(3H,s); 2.35(3H,s), 3.76 (3H,s), 5.14(2H,s), 5.84(1H,s), 6.73(1H,d,J=7.3), 6.77(1H,s), 7.05(1H,d,J=7.3), 7.38-7.48(3H,m), 7.66(1H,d,J=7.3)。

### 实施例 9

15 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 硝基乙酸甲酯 ( 化合物序号 439 ) 的合成

将 2 - 氯 - 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] 乙酸甲酯 ( 0.35g, 1.1mmol ) 亚硝酸钠 ( 0.13g, 1.9mmol ) 和间苯三酚 ( 0.145g, 1.1mmol ) 在 N,N - 二甲基甲酰胺 ( 10ml ) 中的溶液, 于室温下搅拌六小时。向该混合物中加入水, 用乙醚萃取所得混合物, 依次用水和饱和盐水洗涤, 无水硫酸钠干燥。蒸去溶剂, 所得残余物用硅胶柱色谱 ( 正己烷/二氯甲烷 = 1:1 ) 提纯, 得到所需化合物 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 硝基乙酸甲酯油状物 ( 0.08g, 22 % )。

25 NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 2.09(3H,s), 2.34(3H,s), 3.85 (3H,s), 5.05(1H,d,J=11.0), 5.10(1H,d,J=11.0), 6.68(1H,s), 6.74 (1H,d,J=7.3), 6.75(1H,s), 7.03(1H,d,J=7.3), 7.48-7.53(2H,m), 7.61-7.66(1H,m)。

30

## 实施例 10

2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 甲硫乙酸甲酯  
( 化合物序号 162 ) 的合成

将 2 - 氯 - 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] 乙酸甲酯  
5 ( 0.21g, 0.66mmol ) 和硫代甲醇钠 ( 0.06g, 0.86mmol ) 在 N,N - 二甲  
基甲酰胺 ( 3ml ) 中的溶液, 于室温搅拌 24 小时。加入水, 混合物用乙  
醚萃取, 依次用水和饱和盐水洗涤, 无水硫酸钠干燥。蒸去溶剂, 残余  
物用硅胶柱色谱 ( 正己烷/乙酸乙酯 = 9:1 ) 提纯, 得到所需化合物 2 -  
[ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 甲基硫代乙酸甲酯  
10 ( 0.13g, 60 % ) 油状物。

NMR (  $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$  ): 2.10 (3H, s), 2.20 (3H, s),  
2.34 (3H, s), 3.71 (3H, s), 4.95 (1H, s), 5.13 (2H, s),  
6.72 (1H, d,  $J=7.3$ ), 6.77 (1H, s), 7.04 (1H, d,  $J=7.3$ ), 7.30-7.40  
15 (2H, m), 7.46 (1H, dd,  $J=7.3, 1.8$ ), 7.68 (1H, dd,  $J=7.3, 1.8$ ).

## 实施例 11

2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 甲基亚磺酰基  
乙酸甲酯 ( 化合物序号 358 ) 和 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 )  
20 苯基 ] - 2 - 甲基磺酰基乙酸甲酯 ( 化合物 359 ) 的合成

将 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 甲硫基乙酸  
甲酯 ( 0.13g, 0.39mmol ) 的二氯甲烷 ( 5ml ) 溶液于 0 °C 搅拌。向其  
中加入 80 % 间 - 氯过苯甲酸 ( 0.12g, 0.56mmol )。于 0 °C 搅拌该混  
合物 2 小时, 用硫代硫酸钠水溶液、1N 氢氧化钠溶液洗涤, 无水硫酸钠  
25 干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱 ( 正己烷/乙酸乙酯 = 3/1, 然后  
1/1 ) 提纯, 得到所需化合物 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯  
基 ] - 2 - 甲磺酰基乙酸甲酯 ( 0.08g, 56% ) 晶体, 和 2 - [ 2 - ( 2,5  
- 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] - 2 - 甲基亚磺酰基乙酸甲酯 ( 0.03g,  
22 % ) 油状物。

30 化合物序号 359; m.p.122 - 124 °C

NMR ( $\delta$  ppm TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 2.17(3H,s), 2.34(3H,s), 3.03  
(3H,s), 3.81(3H,s), 5.02(1H,d,J=11.6), 5.39(1H,d,J=11.6),  
5.67 (1H,s), 6.72(1H,d,J=7.3), 6.79(1H,s), 7.03(1H,d,J=7.3),  
7.40-7.55(3H,m), 7.81-7.85(1H,m).

5 化合物序号 358; NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 2.17  
(3H,s), 2.34 and 2.36 ( 共3H ), 2.44 和 2.63 (共3H  
) , 3.78 and 3.81 ( 共3H ), 4.98-5.22 ( 共3H ),  
6.71-7.81( 共7H ).

### 10 实施例 12

2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] 丁腈的合成

于 0 °C 搅拌 2 - [ 2 - ( 2,5 - 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] 乙腈  
( 2.00g,8.0mmol ) 的 N,N - 二甲基甲酰胺 ( 20ml ) 溶液。向其中加入  
60 % 油状氢化钠 ( 0.38g , 9.5mmol ) , 然后经 5 分钟滴加完乙基碘  
15 ( 1.37g , 8.8mmol ) 。 1 小时后加入水, 乙酸乙酯萃取该混合物, 依  
次用水和饱和盐水洗涤, 无水硫酸钠干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱  
色谱(正己烷/乙酸乙酯 = 19/1)提纯, 得到所需化合物 2 - [ 2 - ( 2,5  
- 二甲基苯氧基甲基 ) 苯基 ] 丁腈 ( 1.91g, 86 % ) 油状物。

20 NMR ( $\delta$  ppm TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 1.10(3H,t,J=7.3), 1.97  
(2H,quintet,J=7.3), 2.16(3H,s), 2.34(3H,s), 4.05(1H,t,J=7.3),  
4.96(1H,d,J=11.0), 5.05(1H,d,J=11.0), 6.73(1H,d,J=7.3), 6.76  
(1H,s), 7.04(1H,d,J=7.3), 7.31-7.44(3H,m), 7.55(1H,d,J=7.9)。

### 25 实施例 13

2 - [2 - (2,5 - 二甲基苯氧基甲基)苯基]丁酰胺(化合物序号 159)的  
合成

将 2 - [2 - (2,5 - 二甲基苯氧基甲基)苯基]丁腈 ( 1.00g, 3.6mmol )  
和 96 % 氢氧化钠(0.44g, 10.6mmol)在甲醇(10ml)中的溶液在回流下加热  
30 44 小时。蒸去溶剂, 然后加入水。用乙酸乙酯萃取该混合物,饱和盐水洗  
涤并用无水硫酸钠干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙  
酯 = 3/1)提纯, 得到所需的化合物 2 - [2 - (2,5-二甲基苯氧基甲基)苯基]

丁酰胺(0.28g,26 %)白色结晶。

mp.: 100-101°C

NMR ( $\delta$  ppm TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 0.89(3H,t,J=7.3), 1.78-

5 1.89(1H,m), 2.15(3H,s), 2.15-2.28(1H,m), 2.36(3H,s), 3.73

(1H,t,J=7.3), 4.84(1H,d,J=11.0), 5.20(1H,brs), 5.26

(1H,d,J=11.0), 5.86(1H,brs), 6.77(1H,d,J=7.3), 7.30

(1H,d,J=7.3), 7.38-7.43(2H,m), 7.49(1H,d,J=7.3).

10

#### 实施例 14

2 - [2 - (2,5 - 二甲基苯氧基甲基)苯基] - N - 甲基丁酰胺(化合物  
序号 146)和 N,N - 二甲基 - 2 - [2 - (2,5 - 二甲基苯氧基甲基)苯基]丁  
酰胺(化合物序号 163)的合成

将 2 - [2 - 2,5 - 二甲基苯氧基甲基)苯基]丁酰胺(0.19g, 0.6mmol)  
15 溶于 N,N - 二甲基甲酰胺 (5ml) 中, 于 0 °C 将该溶液搅拌。向其中加  
入 60 % 油状氢化钠(0.05g, 1.3mmol)。5 分钟后加入甲基碘(0.18g,  
1.3mmol),然后于室温搅拌该混合物 2 小时。于 0 °C 依次加入冰和水, 用  
乙酸乙酯萃取该化合物。依次用水和饱和盐水洗涤该萃取物, 无水硫酸  
20 钠干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙酯 = 4/1, 然后  
3/1)提纯, 得到所需化合物 N,N - 二甲基 - 2 - [2-(2,5 - 二甲基苯氧基  
甲基)苯基]丁酰胺(0.06g,29%)白色晶体和 2 - [2 - (2,5 - 二甲基苯氧基甲  
基)苯基] - N - 甲基丁酰胺(0.11g,55%)白色结晶。

化合物序号 163; mp: 62 - 62.5 °C

25

NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 0.94(3H,t,J=7.3), 1.62-

1.77(1H,m), 2.09-2.26(1H,m), 2.14(3H,s), 2.36(3H,s), 2.85

(3H,s), 2.95(3H,s), 3.93(1H,dd,J=9.1,4.9), 4.96(1H,d,J=11.0),

5.15(1H,d,J=11.0), 6.73(1H,d,J=7.3), 6.80(1H,s), 7.05

(1H,d,J=7.9), 7.23-7.46(4H,m).

30

化合物序号 . 146; mp.: 108-110°C

NMR ( $\delta$  ppm TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 0.86(3H,t,J=7.3), 1.77-  
 1.88(1H,m), 2.16(3H,s), 2.16-2.29(1H,m), 2.35(3H,s), 2.67  
 (3H,d,J=4.9), 3.63(1H,t,J=7.3), 4.84(1H,d,J=11.0), 5.24  
 (1H,d,J=11.0), 5.80(1H,brs), 6.76(1H,d,J=7.3), 6.84(1H,s),  
 5 7.06(1H,d,J=7.3), 7.27(1H,t,J=7.3), 7.38(2H,t,J=7.3), 7.49  
 (1H,d,J=7.3).

### 实施例 15

2 - [2 - (2,5-二甲基苯氧基甲基)苯基]丁酸甲酯 (化合物序号 145 )  
 10 的合成

将 2 - [2 - (2,5 - 二甲基苯氧基甲基)苯基]丁腈(0.67g, 2.4mmol)和  
 96 % 氢氧化钠(0.73g,17.5mmol)在乙醇(8ml)中的溶液回流加热 43 小时。  
 蒸去溶剂, 然后加入水。用 1N 盐酸将混合物 PH 调至 3, 并用乙酸乙酯  
 萃取。用无水硫酸钠干燥该萃取液, 然后蒸去溶剂。将该粗产物溶于 N,N  
 15 - 二甲基甲酰胺(5ml)中, 并在室温下搅拌。依次向其中加入甲基碘(0.50g,  
 3.5mmol)和碳酸钾 (0.50g, 3.6mmol)。1 小时后加入水, 然后用乙酸乙酯  
 萃取该混合物。顺次用水和饱和盐水洗涤该萃取物, 然后用无水硫酸钠  
 干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙酯 = 9/1)提纯, 得  
 20 到所需化合物 2 - [2 - (2,5 - 二甲基苯氧基甲基)苯基]丁酸甲酯 (0.62g,  
 83%)白色结晶。

mp.: 62-65°C

NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 0.91(3H,t,J=7.3), 1.78-1.89  
 (1H,m), 2.07-2.21(1H,m), 2.18(3H,s), 2.34(3H,s), 3.64(3H,s),  
 25 3.84(1H,t,J=7.3), 5.02(1H,d,J=11.0), 5.19 (1H,d,J=11.0), 6.71  
 (1H,d,J=7.3), 6.78(1H,s), 7.04(1H,d,J=7.3), 7.27-7.44(2H,m),  
 7.44-7.47(2H,m).

### 实施例 16

30  $\alpha$  - 甲氧基 - N - 甲基 - ( 2,3,5 - 三甲基苯氧基甲基)苯乙酰胺(化  
 合物序号 465)的合成

将 2 - 氯甲基 -  $\alpha$  - 甲氧基 - N - 甲基苯乙酰胺 (0.25g, 1.1mmol) 和 2,3,5 - 三甲基苯酚(0.18g, 1.3mmol)的 N,N - 二甲基甲酰胺(3ml)溶液于 0 °C 搅拌, 然后向溶液中加入 60 % 油状氢化钠(0.08g, 2.0mmol)。于 0 °C 搅拌该混合物 70 分钟, 然后在室温搅拌 1 小时, 并依次加入冰和水。

5 用乙酸乙酯萃取该混合物, 用饱和盐水洗涤, 无水硫酸钠干燥。蒸去溶剂, 用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙酯 = 7/3)提纯该残余物, 得到所需化合物  $\alpha$  - 甲氧基 - N - 甲基 - (2,3,5 - 三甲基苯氧基甲基)苯乙酰胺(0.17g, 50 %)油状物。

10 NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 2.11(3H, s), 2.23(3H, s),  
2.29(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.03(1H, s),  
5.03(1H, d, J=11.6), 5.44(1H, d, J=11.6), 6.64(1H, s), 6.68(1H, s),  
6.80(1H, brs), 7.32-7.43(3H, m), 7.50-7.53(1H, m).

#### 实施例 17

15 (3 - 氯 - 5 - 三氟甲基 - 2 - 吡啶氧基甲基) -  $\alpha$  - 甲氧基 - N - 甲基苯乙酰胺(化合物序号 427)的合成

于 0 °C 搅拌 2 - 羟甲基 -  $\alpha$  - 甲氧基 - N - 甲基苯乙酰胺(1.00g, 4.8mmol)的 N,N - 二甲基甲酰胺(5ml)溶液, 并向其中加入 60 % 油状氢化钠(0.19g, 4.8mmol)。于 0 °C 将该混合物搅拌 30 分钟, 然后加入 2,3, -

20 二氯 - 5 - 三氟甲基吡啶(1.24g, 5.7mmol), 该混合物于 0 °C 搅拌 2 小时, 然后依次加入冰和水。用乙醚萃取该混合物, 饱和盐水洗涤, 无水硫酸钠干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙酯 = 1/1)提纯, 得到所需化合物(3-氯 - 5 - 三氟甲基 - 2 - 吡啶氧基甲基) -  $\alpha$  - 甲氧基 - N - 甲基苯乙酰胺(1.40g, 75%)白色晶体。

25 mp.: 133-135°C

NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 2.83(3H, d, J=4.9), 3.38  
(3H, s), 5.19(1H, s), 5.60(1H, d, J=12.2), 5.92(1H, d, J=12.2),  
6.80 (1H, brs), 7.28-7.40(3H, m), 7.55- 7.58(1H, m), 7.84(1H, s),  
30 8.32 (1H, s).

### 实施例 18

按照与实施例 4 - 17 描述的相同方法, 合成式 (I) 的各种化合物。由此制得的化合物及其代表性化合物的物理数据列于下表。在这些表格中, U, V 和 W 代表 Q 表示的式 (XX) 基团中取代基。在该表中还列出了

5 实施例 4 - 17 中制得的化合物及它们的物理数据。

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
139	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
140	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
141	H	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
142	H	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
143	H	OCOCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
144	H	OCOCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
145	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
146	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
147	H	NH <sub>2</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
148	H	NH <sub>2</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
149	H	Cl	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
150	H	Cl	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
151	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
152	H	OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
153	H	OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
154	H	CF <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
155	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
156	H	OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
159	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	NH <sub>2</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
160	H	SCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
161	H	OCH <sub>3</sub>	O	NH <sub>2</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
162	H	SCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
163	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
165	H	OCH <sub>3</sub>	O	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
166	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
167	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	OH	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
169	H	OCH <sub>3</sub>	S	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
170	H	OCH <sub>3</sub>	S	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
171	H	OCOCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	H	H	H
173	H	OCOCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	2-CH <sub>3</sub>	H	H
174	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	4-Cl	H	H
175	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	OH	O	0	4-OCH <sub>3</sub>	H	H
176	H	OCH <sub>3</sub>	O	SCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
177	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	NH <sub>2</sub>	O	0	4-OCH <sub>3</sub>	H	H

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
178	H	OCOCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	H
179	H	OCH <sub>3</sub>	O	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	H	H
180	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	4-OCH <sub>3</sub>	H	H
181	H	OCOCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	H	H	H
182	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	H	H	H
183	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	H	H	H
184	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	H	H	H
185	H	OCH <sub>3</sub>	O	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-Cl	H
186	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-Cl	H
188	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	H	H	H
189	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	4-Cl	H	H
193	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-Cl	H	H
194	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	H	H
195	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	H	H	H
196	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-Cl	H	H
197	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	H	H

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
198	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	H	H	H
205	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-Cl	5-Cl	H
206	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-Cl	4-Cl	H
207	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-CF <sub>3</sub>	H	H
208	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	4-OCH <sub>3</sub>	H	H
209	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	4-CH <sub>3</sub>	H	H
210	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-CH <sub>3</sub>	H	H
211	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	4-CH <sub>3</sub>	H	H
212	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-CH <sub>3</sub>	H	H
213	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-Cl	5-Cl	H
214	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-CF <sub>3</sub>	H	H
215	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	4-OCH <sub>3</sub>	H	H
216	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub>	H
217	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub>	H

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
218	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	H
219	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	H
220	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	H
221	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	H
222	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
223	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
224	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>
225	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>
226	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>
227	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>
228	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>
229	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>
230	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-Cl	H	H
231	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-Cl	H	H
232	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-Br	H	H
233	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-Br	H	H
234	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	4-Br	H	H
235	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	4-Br	H	H
236	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	4-F	H	H
237	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	4-F	H	H

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
238	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	4-I	H	H
239	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	4-I	H	H
240	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-Cl	4-Cl	H
241	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-Cl	4-Cl	H
242	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-Cl	5-Cl	H
243	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-Cl	5-Cl	H
244	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-OCH <sub>3</sub>	H	H
245	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-OCH <sub>3</sub>	H	H
246	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-OCH <sub>3</sub>	H	H
247	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-OCH <sub>3</sub>	H	H
248	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H
249	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H
250	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	H
251	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	H
252	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	4-OCH <sub>2</sub> C≡CH	H	H
253	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	4-OCH <sub>2</sub> C≡CH	H	H
254	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-OCHF <sub>2</sub>	H	H
255	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-OCHF <sub>2</sub>	H	H
256	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	4-OCHF <sub>2</sub>	H	H
257	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	4-OCHF <sub>2</sub>	H	H

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
258	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-OPh	H	H
259	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-OPh	H	H
260	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-OCH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub>	H
261	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-OCH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub>	H
262	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-Cl	4-Cl	H
263	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-Cl	H
264	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-Br	H
265	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-Br	H
266	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-Cl	4-CH <sub>3</sub>	H
267	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-Cl	4-CH <sub>3</sub>	H
268	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl	H
269	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl	H
270	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl
271	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl
272	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-Cl	4-CH <sub>3</sub>	5-Cl
273	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-Cl	5-CF <sub>3</sub>	H
274	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-Cl	4-OCH <sub>3</sub>	H
275	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-Br	4-OCH <sub>3</sub>	H
276	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-Cl	4-OCH <sub>3</sub>	H
277	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-OCH <sub>3</sub>	4-Cl	H

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
278	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-Cl	4-OCH <sub>3</sub>	5-Cl
279	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-Cl	4-OCHF <sub>2</sub>	H
280	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-Cl	4-OCHF <sub>2</sub>	H
281	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub>	H
282	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-OCH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	H
283	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-OCHF <sub>2</sub>	H
285	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	4-Cl	H	H
286	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	4-Cl	H	H
288	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	4-CH <sub>3</sub>	H	H
289	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	4-CH <sub>3</sub>	H	H
291	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	3-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	H
292	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	H
293	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	2-CH <sub>3</sub>	H	H
294	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	3-CH <sub>3</sub>	H	H
295	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-CH <sub>3</sub>	H	H
296	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	3-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
297	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
298	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>
299	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H
300	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	3-CF <sub>3</sub>	H	H
301	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-CF <sub>3</sub>	H	H
302	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	3-Cl	H	H
303	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-Cl	H	H
304	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	3-Br	H	H
305	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-Br	H	H
306	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	4-Br	H	H
307	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	4-Br	H	H
308	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	4-F	H	H
309	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	4-F	H	H
310	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	4-I	H	H
311	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-Cl	4-Cl	H
312	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	2-Cl	H	H
313	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-OCH <sub>3</sub>	H	H
314	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H	H
315	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	4-OCH <sub>3</sub>	H	H
316	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	4-OCH <sub>3</sub>	H	H
317	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H	H

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
3 1 8	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-OCH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub>	H
3 1 9	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-OCHF <sub>2</sub>	H	H
3 2 0	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	4-OCHF <sub>2</sub>	H	H
3 2 1	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	H
3 2 2	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	4-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	H
3 2 3	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-OCH <sub>2</sub> C≡CH	H	H
3 2 4	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-OCH <sub>2</sub> C≡CCH <sub>3</sub>	H	H
3 2 5	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	4-OCH <sub>2</sub> C≡CH	H	H
3 2 6	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-OPh	H	H
3 2 7	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	4-OPh	H	H
3 2 8	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	0	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl	H
3 2 9	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-CH <sub>3</sub>	4-Cl	H
3 3 0	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-Cl	4-CH <sub>3</sub>	H
3 3 1	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	2-Cl	5-CF <sub>3</sub>	H
3 3 2	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub>	H
3 3 3	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-OCH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub>	H
3 3 4	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-CH <sub>3</sub>	4-OCHF <sub>2</sub>	H
3 3 5	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-OCHF <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub>	H
3 3 6	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-OCH <sub>3</sub>	4-Cl	H
3 3 7	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-Cl	4-OCH <sub>3</sub>	H

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
338	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-OCHF <sub>2</sub>	4-Cl	H
339	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-Cl	4-OCHF <sub>2</sub>	H
340	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	2-Cl	4-CH <sub>3</sub>	5-OCH <sub>3</sub>
341	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-CH <sub>2</sub> CH =CH <sub>2</sub>	4-CH <sub>3</sub>	H
342	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>2</sub> C ≡CH	H
343	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-CH <sub>2</sub> CH =CH <sub>2</sub>	4-Cl	H
344	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3-Cl	4-OCH <sub>2</sub> C ≡CH	H
345	4-Cl	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
346	5-Cl	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
347	4- CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
348	5- CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
349	4- OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
350	5- OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
351	H	OCH <sub>2</sub> C ≡CH	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
352	H	OCHF <sub>2</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
353	H	OCOSCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
354	H	OSO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
355	H	OSO <sub>2</sub> Ph- 4-CH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
356	H	OCONHCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
357	H	OCON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
358	H	SOCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
359	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
360	H	SOCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
361	H	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
362	H	NHCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
363	H	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
364	H	NO <sub>2</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
365	H	NO <sub>2</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	H	H	H
366	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	S	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
367	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	NH	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
368	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	NCH <sub>3</sub>	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
369	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	NCHO	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
370	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	NCOCH <sub>3</sub>	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
371	H	OCH <sub>3</sub>	S	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	H	H
372	H	OCH <sub>3</sub>	S	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-Cl	H
373	H	SCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	H	H
374	H	SCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-Cl	H
375	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	H	H
376	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-Cl	H
377	H	SCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	H	H	H

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
379	H	SCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	4-CH <sub>3</sub>	H	H
380	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	4-SCH <sub>3</sub>	H	H
381	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	S	1	2-CH <sub>3</sub>	H	H
382	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	S	1	2-CH <sub>3</sub>	4-Cl	H
383	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	4-SCH <sub>3</sub>	H	H
384	H	CH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
385	H	OCOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
386	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
387	H	OCH <sub>3</sub>	O	NH <sub>2</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	H	H
388	H	OCH <sub>3</sub>	O	NH <sub>2</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-Cl	H

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	Q
389	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	6-Cl-咪啉-4-基
390	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -咪啉-2-基
391	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	3,5-Cl <sub>2</sub> -吡啉-2-基
392	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	5-Cl-吡啉-2-基
393	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	5-CF <sub>3</sub> -吡啉-2-基
394	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	5-CF <sub>3</sub> -6-Cl-吡啉-2-基
395	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	喹啉-4-基
396	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	喹唑啉-4-基
397	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	0	苯并噻唑-2-基
398	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	苯并噻唑-2-基
399	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	苯并噻唑-2-基
400	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	喹啉-4-基
401	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	喹啉-4-基
402	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	喹唑啉-4-基
403	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	喹唑啉-4-基
404	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	1,3-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -4-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> - 吡唑-5-基
405	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	1,3-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -4-CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> - 吡唑-5-基
406	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	1-CH <sub>3</sub> -4-CHO- 吡唑-5-基
407	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	1-CH <sub>3</sub> -4-CHO- 吡唑-5-基
408	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	5-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> - 咪啉-4-基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	Q
409	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	5-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -6-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> - 嘧啶-4-基
410	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -嘧啶-2-基
411	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	4,6-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -嘧啶-2-基
412	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	6-Cl-嘧啶-4-基
413	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	6-Cl-嘧啶-4-基
414	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	5-Cl-6-CH <sub>3</sub> -嘧啶-4-基
415	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	5-Cl-6-CH <sub>3</sub> -嘧啶-4-基
416	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	5-CF <sub>3</sub> -6-Cl-吡啶-2-基
417	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	5-CF <sub>3</sub> -6-Cl-吡啶-2-基
418	H	OH	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-CF <sub>3</sub> -6-Cl-吡啶-2-基
419	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-CF <sub>3</sub> -6-Cl-吡啶-2-基
420	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-CF <sub>3</sub> -6-Cl-吡啶-2-基
421	H	OH	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基
422	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基
423	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基
425	H	OH	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-Cl-5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基
426	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-Cl-5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基
427	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-Cl-5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基
428	H	OH	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	Q
4 2 9	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基
4 3 0	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基
4 3 1	H	OH	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3,5-Cl <sub>2</sub> -吡啶-2-基
4 3 2	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3,5-Cl <sub>2</sub> -吡啶-2-基
4 3 3	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3,5-Cl <sub>2</sub> -吡啶-2-基
4 3 4	H	OH	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-Cl-吡啶-3-基
4 3 6	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-Cl-吡啶-3-基
4 3 7	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-Cl-吡啶-3-基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
4 3 8	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	4-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H
4 3 9	H	NO <sub>2</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	Q
4 4 1	H	OH	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	5-CF <sub>3</sub> -6-Cl-吡啶-2-基
4 4 3	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	5-Cl-吡啶-2-基
4 4 6	H	OH	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-CF <sub>3</sub> -5-Cl-吡啶-2-基
4 4 7	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	3-CF <sub>3</sub> -5-Cl-吡啶-2-基
4 4 8	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-CF <sub>3</sub> -5-Cl-吡啶-2-基
4 5 1	H	OH	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	6-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	Q
4 5 2	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	6-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基
4 5 3	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	6-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基
4 5 4	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	5-Cl-吡啶-2-基
4 5 5	H	OH	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	5-Cl-吡啶-2-基
4 5 7	H	OH	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	5-CF <sub>3</sub> -3,6-Cl <sub>2</sub> -吡啶-2-基
4 5 8	H	OCH <sub>3</sub>	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	5-CF <sub>3</sub> -3,6-Cl <sub>2</sub> -吡啶-2-基
4 5 9	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	5-CF <sub>3</sub> -3,6-Cl <sub>2</sub> -吡啶-2-基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
4 6 0	H	OCH <sub>3</sub>	S	NH <sub>2</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
4 6 1	H	OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	S	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
4 6 2	H	NH <sub>2</sub> ·HCl	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
4 6 3	H	NH <sub>2</sub> ·HCl	O	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
4 6 5	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	Q
4 6 6	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-Cl-吡啶-2-基
4 6 7	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	O	1	3-CH <sub>3</sub> -吡啶-2-基
4 6 8	H	OCH <sub>3</sub>	O	NHCH <sub>3</sub>	S	1	3,5-Cl <sub>2</sub> -吡啶-2-基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Z	Y	M	n	U	V	W
4 6 9	H	OCH <sub>3</sub>	O	N(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	4-Cl	H
4 7 0	H	OCH <sub>3</sub>	O	OH	O	1	2-CH <sub>3</sub>	5-CH <sub>3</sub>	H
4 7 1	H	OCH <sub>3</sub>	S	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	H	H
4 7 2	H	OCH <sub>3</sub>	O	NCH <sub>3</sub>	O	1	2-Cl	5-CH <sub>3</sub>	H
4 7 3	H	OCH <sub>3</sub>	O	NCH <sub>3</sub>	O	1	2-CH <sub>3</sub>	6-CH <sub>3</sub>	H

化合物 序号	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ $\delta$ ppm
139	2.21(3H, s), 2.33(3H, s), 3.40(3H, s), 3.70(3H, s), 5.10(1H, d, J=12.2), 5.14(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 6.71(1H, d, J=7.3), 6.76(1H, s), 7.04(1H, d, J=7.3), 7.33-7.40(2H, m), 7.50-7.56(2H, m)
140	86 - 88 °C
141	2.23(3H, s), 2.32(3H, s), 3.36(3H, s), 3.71(3H, s), 4.67(1H, d, J=6.7), 4.75(1H, d, J=6.7), 5.17(1H, d, J=12.2), 5.23(1H, d, J=12.2), 5.49(1H, s), 6.71(1H, d, J=7.9), 6.75(1H, s), 7.04(1H, d, J=7.3), 7.34-7.40(2H, m), 7.53-7.57(2H, m)
142	81 - 82 °C
143	77 - 80 °C
144	114 - 115 °C
145	62 - 65 °C
146	108 - 110 °C
149	2.20(3H, s), 2.35(3H, s), 3.76(3H, s), 5.14(2H, s), 5.84(1H, s), 6.73(1H, d, J=7.3), 6.77(1H, s), 7.05(1H, d, J=7.3), 7.38-7.48(3H, m), 7.66(1H, d, J=7.3)
150	111 ~ 113 °C
151	1.26(3H, t, J=7.3), 2.21(3H, s), 2.32(3H, s), 3.42-3.67(2H, m), 3.70(3H, s), 5.12(1H, d, J=12.2), 5.23(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 6.70(1H, d, J=7.3), 6.75(1H, s), 7.04(1H, d, J=7.3), 7.32-7.38(2H, m), 7.49-7.58(2H, m)

化合物 序号	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ $\delta$ ppm
1 5 2	0.89(3H, t, J=7.3), 1.32-1.45(2H, m), 1.57-1.68(2H, m), 2.22(3H, s), 2.33(3H, s), 3.39-3.47(1H, m), 3.52-3.60(1H, m), 3.70(3H, s), 5.12(1H, d, J=12.2), 5.20(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 6.71(1H, d, J=7.9), 6.75(1H, s), 7.04(1H, d, J=7.3), 7.34-7.39(2H, m), 7.52-7.55(2H, m)
1 5 5	9 8 - 1 0 0 °C
1 5 6	5 8 - 6 0 °C
1 5 9	1 0 0 - 1 0 1 °C
1 6 1	2.19(3H, s), 2.32(3H, s), 3.36(3H,s), 5.02(1H, s), 5.07(1H, d, J=11.6), 5.40(1H, d, J=11.6), 5.88(1H, brs), 6.70(1H, d, J=7.3), 6.71(1H, brs), 6.78(1H, s), 7.03(1H, d, J=7.3), 7.32-7.40(2H, m), 7.42-7.48(1H, m), 7.50-7.53(1H, m)
1 6 2	2.10(3H, s), 2.20(3H, s), 2.34(3H, s), 3.71(3H, s), 4.95(1H, s), 5.13(2H, s), 6.72(1H, d, J=7.3), 6.77(1H, s), 7.04(1H, d, J=7.3), 7.30-7.40(2H, m), 7.46(1H, dd, J=7.3, 1.8), 7.68(1H, dd, J=7.3, 1.8)
1 6 3	6 2 - 6 2 . 5 °C
1 6 5	2.17(3H, s), 2.33(3H, s), 2.87(3H, s), 3.00(3H, s), 3.44(3H, s), 5.02(1H, d, J=11.6), 5.26(1H, d, J=11.6), 5.32(1H,s), 6.71(1H, d, J=7.3), 6.79(1H, s), 7.03(1H, d, J=7.3), 7.30-7.40(3H, m), 7.50-7.54(1H, m)
1 6 6	8 0 - 8 1 °C

化合物 序号	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ $\delta$ ppm
170	2.20(3H, s), 2.32(3H, s), 3.23(3H, d, J=4.8), 3.35(3H, s), 5.12(1H, d, J=11.6), 5.40(1H, s), 5.58(1H, d, J=11.6), 6.70(1H, d, J=7.3), 6.81(1H, s), 7.03(1H, d, J=7.3), 7.28-7.38(3H, m), 7.48-7.52(1H, m), 8.78(1H, brs)
171	2.10(3H, s), 2.78(3H, d, J=4.8), 6.18(1H, brs), 6.34(1H, s), 6.87(1H, dd, J=8.2, 1.0), 6.97-7.00(2H, m), 7.11-7.16(2H, m), 7.26-7.36(3H, m), 7.58(1H, dd, J=7.8, 1.7)
173	2.15(3H, s), 2.25(3H, s), 2.74(3H, d, J=4.9), 5.10(1H, d, J=11.9), 5.44(1H, d, J=11.9), 6.29(1H, brs), 6.36(1H, s), 6.91(1H, t, J=7.3), 6.98 (1H, d, J=7.3), 7.14-7.19(2H, m), 7.34-7.40(2H, m), 7.46-7.56(2H, m)
174	3.39(3H, s), 3.70(3H, s), 5.05(1H, s), 5.09(1H, d, J=12.0), 5.25(1H, d, J=12.0), 6.86-6.92(2H, m), 7.22-7.26(2H, m), 7.35-7.38(2H, m), 7.45-7.49(2H, m)
175	1.11(3H, t, J=7.3), 1.99(2H, 五重峰, J=7.3), 3.81(3H, s), 4.24(1H, t, J=7.3), 6.74(1H, dd, J=7.9, 1.2), 6.87-6.97(4H, m), 7.11(1H, ddd, J=7.9, 7.6, 1.2), 7.21(1H, ddd, J=7.9, 7.6, 1.8), 7.49(1H, dd, J=7.6, 1.8)
176	2.20(3H, s), 2.23(3H, s), 2.32(3H, s), 3.46(3H, s), 5.05(1H, d, J=12.2), 5.15(1H, s), 5.34(1H, d, J=12.2), 6.70(1H, d, J=7.3), 6.76(1H, s), 7.03(1H, d, J=7.3), 7.32-7.40(2H, m), 7.47-7.57(2H, m)
177	65 - 67 °C
178	2.12(3H, s), 2.23(6H, s), 2.78(3H, d, J=4.9), 6.26(1H, brs), 6.36(1H, s), 6.72(1H, dd, J=7.9, 1.8), 6.80(1H, s), 6.82(1H, d, J=7.9), 7.09(2H, t, J=7.3), 7.25(1H, dt, J=1.8, 7.9), 7.56(1H, dd, J=7.3, 1.8)
179	98 - 99.5 °C
180	0.91(3H, t, J=7.3), 1.65-1.92(1H, m), 2.04-2.17(1H, m), 3.61(3H, s), 3.78(3H, s), 3.98(1H, t, J=7.3), 6.78(1H, dd, J=7.9, 1.8), 6.82-6.93(4H, m), 7.05(1H, t, J=7.3), 7.15(1H, dt, J=7.9, 1.8), 7.35(1H, dd, J=7.3, 1.8)
181	39 - 41 °C

化合物 序号	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ $\delta$ ppm
1 8 2	3.41(3H, s), 3.66(3H, s), 5.24(1H, s), 6.90(1H, d, J=7.9), 6.99(2H, d, J=7.3), 7.10(1 H, t, J=7.3), 7.25-7.36(3H, m), 7.52(1H, dd, J=7.9, 1.8)
1 8 3	1.21(3H, t, J=7.3), 3.44-3.65(2H, m), 3.64(3H, s), 5.35(1H, s), 6.88(1H, t, J=7.9), 6.98(2H, d, J=7.9), 7.08(1H, t, J=7.3), 7.14(1H, t, J=7.3), 7.23-7.34(3H, m), 7.55(1H dd, J=7.9, 1.8)
1 8 4	2.82(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.03(1H, s), 6.82(1H, brs), 6.88(1H, d, J=7.9), 7.04(2H, d, J=7.9), 7.12(2H, t, J=7.9), 7.23-7.42(4H, m)
1 8 5	1.20(3H, d, J=7.3), 2.24(3H, s), 3.40(3H, s), 4.08-4.27(2H, m), 5.06(1H, s), 5.14(1H, d, J=12.2), 5.29(1H, d, J=12.2), 6.83(1H, d, J=7.9), 7.08-7.13(2H, m), 7.33-7.39(2H, m), 7.47-7.55(2H, m)
1 8 6	1 1 1 - 1 1 3 $^{\circ}\text{C}$
1 8 8	1.16(3H, t, J=7.3), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.50(2H, q, J=7.3), 5.15(1H, s), 6.86(1H, d, J=7.9), 6.90(1H, brs), 7.03(2H, d, J=7.9), 7.09(2H, t, J=7.9), 7.20-7.37(4H, m)
1 8 9	8 7 - 8 8 $^{\circ}\text{C}$
1 9 3	3.42(3H, s), 3.70(3H, s), 5.15(1H, s), 5.20(1H, d, J=12.0), 5.39(1H, d, J=12.0), 6.93(1H, dt, J=1.8, 8.0), 7.03(1H, d, J=8.0), 7.21(1H, dt, J=1.8, 8.0), 7.36-7.40(3H, m), 7.51-7.59(2H, m)
1 9 4	2.26(3H, s), 3.40(3H, s), 3.70(3H, s), 5.13(1H, s), 5.13(1H, d, J=12.0), 5.30(1H, d, J=12.0), 6.89-6.94(2H, m), 7.10-7.20(2H, m), 7.35-7.40(2H, m), 7.50-7.52(2H, m)
1 9 5	3.40(3H, s), 3.70(3H, s), 5.11(1H, s), 5.11(1H, d, J=12.0), 5.30(1H, d, J=12.0), 6.90-7.00(3H, m), 7.25-7.38(4H, m), 7.47-7.51(2H, m)
1 9 6	8 6 - 8 7 $^{\circ}\text{C}$
1 9 7	9 1 - 9 2 $^{\circ}\text{C}$
1 9 8	2.81(3H, s), 3.35(3H, s), 5.00(1H, s), 5.08(1H, d, J=12.0), 5.48(1H, d, J=12.0), 6.80(1H, brs), 6.93-6.97(3H, m), 7.25-7.49(6H, m)
2 0 5	6 9 - 7 2 $^{\circ}\text{C}$

化合物 序号	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3) \delta$ ppm
2 0 6	3.41(3H, s), 3.72(3H, s), 5.10(1H, s), 5.18(1H, d, J=12.0), 5.34(1H, d, J=12.0); 6.92(1H, d, J=8.6), 6.17(1H, dd, J=9.0; 2.4), 7.36-7.40(2H, m), 7.50-7.56(2H, m)
2 0 7	3.41(3H, s), 3.71(3H, s), 5.06(1H, s), 5.16(1H, d, J=12.0), 5.34(1H, d, J=12.0), 7.17(1H, m), 7.22-7.30(2H, m), 7.38-7.42(3H, m), 7.47-7.52(2H, m)
2 0 8	3.39(3H, s), 3.70(3H, s), 3.77(3H, s), 5.04(1H, d, J=12.0), 5.11(1H, s), 5.24(1H, d, J=12.0), 6.80-6.88(2H, m), 6.90-6.95(2H, m), 7.30-7.40(2H, m), 7.45-7.55(2H, m)
2 0 9	2.29(3H, s), 3.39(3H, s), 3.70(3H, s), 5.07(1H, d, J=12.0), 5.11(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.0), 6.89(2H, d, J=18.6), 7.09(1H, t, J=8.6), 7.30-7.40(2H, m), 7.45-7.51(2H, m)
2 1 0	2.34(3H, s), 3.40(3H, s), 3.70(3H, s), 5.08(1H, d, J=12.0), 5.11(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.0), 6.89(2H, d, J=8.6), 6.91(1H, s), 7.18(1H, t, J=8.0), 7.32-7.40(2H, m), 7.45-7.55(2H, m)
2 1 1	9 8 - 1 0 0 °C
2 1 2	2.33(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.8), 3.35(3H, s), 5.00(1H, s), 5.04(1H, d, J=12.0), 5.48(1H, d, J=12.0), 6.75-6.81(3H, m), 7.17(1H, t, J=7.3), 7.30-7.46(4H, m)
2 1 3	2.82(3H, d, J=4.8), 3.36(3H, s), 4.94(1H, s), 5.05(1H, d, J=12.0), 5.47(1H, d, J=12.0), 6.80(1H, brs), 6.89(2H, d, J=1.2), 6.96(1H, t, J=1.2), 7.33-7.47(4H, m)
2 1 4	2.82(3H, d, J=4.8), 3.36(3H, s), 4.98(1H, s), 5.13(1H, d, J=12.0), 5.53(1H, d, J=12.0), 6.81(1H, brs), 7.15-7.26(3H, m), 7.33- 7.50(5H, m)
2 1 5	2.81(3H, d, J=4.8), 3.35(3H, s), 3.76(3H, s), 5.01(1H, s), 5.03(1H, d, J=12.0), 5.42 (1H, d, J=12.0), 6.81(1H, brs), 6.81-6.84(2H, m), 6.86-6.89(2H, m), 7.30-7.48(4H, m)
2 1 6	2.18(3H, s), 2.28(3H, s), 3.40(3H, s), 3.70(3H, s), 5.11(1H, d, J= 12.2), 5.13(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 6.81(2H, d, J=7.8), 7.08(1H, t, J=7.8), 7.35-7.38(2H, m), 7.51-7.54(2H, m)
2 1 7	2.16(3H, s), 2.27(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.02(1H, s), 5.04(1H, d, J=11.6), 5.44(1H, d, J=11.6), 6.80(1H, d, J=7.9), 6.82(1H, brs), 6.84(1H, d, J=7.9), 7.05(1H, t, J=7.9), 7.30- 7.40(3H, m), 7.49-7.52(1H, m)
2 1 8	2.23(3H, s), 2.27(3H, s), 3.39(3H, s), 3.70(3H, s), 5.10(1H, d, J=12.2), 5.11(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 6.81(1H, d, J=7.8), 6.95(1H, d, J=7.8), 6.98(1H, s), 7.34-7.38(2H, m), 7.50-7.54(2H, m)
2 1 9	1 0 4 - 1 0 6 °C

化合物 序号	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ $\delta$ ppm
2 2 1	2.17(3H, s), 2.19(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.00(1H s), 5.02(1H, d, J=12.2), 5.42(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, dd, J=7.9, 2.4), 6.80(1H, d, J=2.4), 6.83(1H, brs), 7.02(1H, d, J=7.9) 7.30-7.50(4H, m)
2 2 3	2.29(6H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 5.00(1H, s), 5.02(1H, d, J=11.0), 5.44(1H, d, J=11.0), 6.63(3H, s), 6.82(1H, brs), 7.29-7.48(4H, m)
2 3 1	2.82(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 4.97(1H, s), 5.04(1H, d, J=12.0), 5.47(1H, d, J=12.0), 6.84(1H, brs), 6.85(1H, dd, J=7.4, 1.8), 6.95(1H, dd, J=7.4, 1.8), 6.99(1H, t, J=1.8), 7.20(1H, t, J=7.4), 7.33-7.45(4H, m)
2 3 3	8 7 - 8 8 $^{\circ}\text{C}$
2 4 5	2.81(3H, d, J=4.9), 3.37(3H, s), 3.85(3H, s), 5.06(1H, s), 5.20(1H, d, J=12.2), 5.37(1H, d, J=12.2), 6.85(1H, brs), 6.96-7.03(4H, m), 7.30-7.35(2H, m), 7.44-7.49(2H, m)
2 6 2	1 2 1 - 1 2 3 $^{\circ}\text{C}$
2 6 3	2.23(3H, s), 3.40(3H, s), 3.70(3H, s), 5.08(1H, s), 5.12(1H, d, J=12.2), 5.27(1H, d, J=12.2), 6.83(1H, d, J=7.9), 7.10(1H, dd, J=7.3, 2.4), 7.33-7.39(2H, m), 7.42-7.55(2H, m)
2 6 7	9 7 - 9 9 $^{\circ}\text{C}$
2 8 2	2.30(3H, s), 2.80(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 3.83(3H, s), 5.06(1H, s), 5.17(1H, d, J=12.2), 5.32(1H, d, J=12.2), 6.73-6.80(2H, m), 6.87(1H, brs), 6.89(1H, d, J=7.9), 7.30-7.35(2H, m), 7.42-7.48(2H, m)
2 8 5	3.40(3H, s), 3.64(3H, s), 5.18(1H, s), 6.87-6.93(3H, m), 7.11(1H, d, J=7.3), 7.26-7.33(3H, m), 7.51(1H, dd, J=7.3, 1.8)
2 8 6	2.81(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 4.99(1H, s), 6.85(1H, brs), 6.86(1H, d, J=8.6), 6.94-6.98(2H, m), 7.14(1H, t, J=7.3), 7.26-7.36(4H, m)
2 8 8	2.33(3H, s), 3.41(3H, s), 3.68(3H, s), 5.26(1H, s), 6.83-6.91(3H, m), 7.11-7.15(3H, m), 7.23-7.28(1H, m), 7.48(1H, dd, J=8.0, 1.8)
2 8 9	2.32(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.04(1H, s), 6.82(1H, brs), 6.84(1H, d, J=8.6), 6.91-6.94(2H, m), 7.08-7.15(3H, m), 7.20-7.26(1H, m), 7.34(1H, dd, J=7.3, 1.8)
2 9 1	2.23(6H, s), 3.4(3H, s), 3.68(3H, s), 5.26(1H, s), 6.71-6.74(1H, m), 6.80-6.86(2H, m), 7.05-7.13(2H, m), 7.22-7.28(1H, m), 7.48(1H, dd, J=7.3, 1.8)

化合物 序号	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ $\delta$ ppm
2 9 2	2.22(6H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 5.04(1H, s), 6.73-6.86(4H, m), 7.05-7.10 (2H, m), 7.20-7.25 (1H, m), 7.34 (1H, dd, J=7.3, 1.8)
2 9 3	3.40(3H, s), 3.71(3H, s), 5.19(1H, s), 5.49(1H, d, J=12.2), 5.67 (1H, d, J=12.2), 6.85(1H, d, J=8.6), 7.35-7.39(2H, m), 7.49-7.53 (2H, m), 7.79(1H, dd, J=7.3, 1.8), 8.46(1H, s)
2 9 4	2.32(3H, s), 3.40(3H, s), 3.67(3H, s), 5.23(1H, s), 6.76-6.90(4H, m), 7.11-7.30(2H, m), 7.49(1H, dd, J=7.3, 1.8)
2 9 5	2.32(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.03(1H, s), 6.80-6.91(5H, m), 7.10-7.28(3H, m), 7.34(1H, dd, J=7.3, 1.8)
2 9 6	2.27(6H, s), 3.40(3H, s), 3.67(3H, s), 5.23(1H, s), 6.61(2H, s), 6.74(1H, s), 6.88(1H, d, J=8.6), 7.13(1H, t, J=8.0), 7.24-7.28(1H, m), 7.49(1H, dd, J=7.3, 1.8)
2 9 7	2.27(6H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.02(1H, s), 6.65(2H, s), 6.73(1H, s), 6.75(1H, brs), 6.86(1H, d, J=8.0), 7.06-7.09(1H, m), 7.21-7.28(1H, m), 7.34(1H, dd, J=7.3, 1.8)
3 2 8	2.28(3H, s), 3.40(3H, s), 3.67(3H, s), 5.18(1H, s), 6.73-6.77(1H, m), 6.86-6.89(2H, m), 7.19(1H, d, J=7.3), 7.25-7.30(2H, m), 7.51(1H, dd, J=7.3, 1.8)
3 2 9	2.33(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.34(3H, s), 4.99(1H, s), 6.77-6.93(4H, m), 7.12(1H, t, J=7.3), 7.24-7.36(3H, m)
3 5 8	2.17(3H, s), 2.34-2.36( 共 3H ), 2.44-2.63( 共 3H ) 3.78 -3.81( 共 3H ), 4.98-5.22( 共 3H ), 6.71-7.81( 共 7H )
3 5 9	1 2 2 - 1 2 4 $^{\circ}\text{C}$
3 6 2	2.16(3H, s), 2.35(3H, s), 2.39(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 4.36(1H, s), 5.13(1H, d, J=11.0), 5.25(1H, d, J=11.0), 6.73(1H, d, J=7.3), 6.84(1H, s), 7.04(1H, d, J=7.3), 7.07(1H, brs), 7.29-7.49(4H, m)
3 6 6	2.26(3H, s), 2.28(3H, s), 2.79(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 4.06(1H, d, J=12.2), 4.69(1H, d, J=12.2), 5.18(1H, s), 6.84(1H, brs), 6.91(1H, d, J=7.3), 7.04(1H, d, J=7.3), 7.14(1H, s), 7.18-7.28(3H, m), 7.36 ( 1H, d, J=7.3)
3 7 2	1.56(3H, s), 2.22(3H, s), 3.23(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.15(1H, d, J=12.2), 5.36(1H, s), 5.58(1H, d, J=12.2), 6.88(1H, d, J=7.9), 7.11(1H, d, J=7.9), 7.13(1H, s), 7.29-7.37(3H, m), 7.45-7.48(1H, m), 8.75(1H, brs)
4 1 3	2.83(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 5.09(1H, s), 5.50(1H, d, J=13.0), 5.86(1H, d, J=13.0), 6.80(1H, s), 6.85(1H, brs), 7.32-7.38 (3H, m), 7.45-7.49(1H, m), 8.57(1H, s)

化合物 序号	mp 或 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$ $\delta$ ppm
4 1 7	1 1 5 - 1 1 7 $^{\circ}\text{C}$
4 2 0	1 3 1 - 1 3 3 $^{\circ}\text{C}$
4 2 1	2.84(3H, d, J=4.9), 4.99(1H, brs), 5.39(1H, s), 5.57(1H, d, J=12.2), 5.67(1H, d, J=12.2), 6.50(1H, brs), 7.00(1H, dd, J=6.7, 6.1), 7.31-7.37(3H, m), 7.49-7.51(1H, m), 7.90(1H, dd, J=6.1, 1.8), 8.27(1H, dd, J=6.7, 1.8)
4 2 2	6 3 - 6 4 $^{\circ}\text{C}$
4 2 3	1 0 5 - 1 0 7 $^{\circ}\text{C}$
4 2 7	1 3 3 - 1 3 5 $^{\circ}\text{C}$
4 2 9	7 9 - 8 1 $^{\circ}\text{C}$
4 3 0	3.40(3H, s), 3.71(3H, s), 5.19(1H, s), 5.49(1H, d, J=12.2), 5.67(1H, d, J=12.2), 6.85(1H, d, J=8.6), 7.35-7.39(2H, m), 7.46-7.52(2H, m), 7.80(1H, dd, J=8.6, 1.8), 8.46(1H, s)
4 3 2	3.42(3H, s), 3.70(3H, s), 5.25(1H, s), 5.49(1H, d, J=12.2), 5.66(1H, d, J=12.2), 7.34-7.38(2H, m), 7.52-7.56(2H, m), 7.65(1H, d, J=2.4), 8.01(1H, d, J=2.4)
4 3 3	1 1 4 - 1 1 5 $^{\circ}\text{C}$
4 3 4	5 8 - 6 0 $^{\circ}\text{C}$
4 3 6	1 0 2 - 1 0 4 $^{\circ}\text{C}$
4 3 7	2.82(3H, d, J=5.5), 3.39(3H, s), 5.03(1H, s), 5.22(1H, d, J=12.0), 5.64(1H, d, J=12.0), 6.82(1H, brs), 7.19(1H, dd, J=8.0, 4.8), 7.33-7.49(5H, m), 8.01(1H, dd, J=4.8, 1.8)
4 3 9	2.09(3H, s), 2.34(3H, s), 3.85(3H, s), 5.05(1H, d, J=11.0), 5.10(1H, d, J=11.0), 6.68(1H, s), 6.74(1H, d, J=7.3), 6.75(1H, s), 7.03(1H, d, J=7.3), 7.48-7.53(2H, m), 7.61-7.66(1H, m)
4 4 3	8 9 - 9 0 $^{\circ}\text{C}$
4 4 8	8 0 - 8 2 $^{\circ}\text{C}$
4 5 3	8 3 - 8 5 $^{\circ}\text{C}$
4 5 4	3.39(3H, s), 3.70(3H, s), 5.19(1H, s), 5.38(1H, d, J=12.2), 5.58(1H, d, J=12.2), 6.73(1H, d, J=9.1), 7.30-7.37(2H, m), 7.47-7.55(3H, m), 8.11(1H, d, J=2.4)

化合物序号	mp或 <sup>1</sup> H-NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm
459	103-105 °C
461	0.87(3H, t, J=7.3), 1.26-1.40(2H, m), 1.51-1.62(2H, m), 2.20(3H, s), 2.31(3H, s), 3.22(3H, d, J=4.9), 3.44(2H, t, J=7.3), 5.14(1H, d, J=11.6), 5.46(1H, s), 5.59(1H, d, J=11.6), 6.69(1H, d, J=7.3), 6.80(1H, s), 7.02(1H, d, J=7.3), 7.31-7.34(3H, m), 7.47-7.51(1H, m), 8.82(1H, brs).
462	205-210 °C
463	105-110 °C
465	2.11(3H, s), 2.23(3H, s), 2.29(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.03(1H, s), 5.03(1H, d, J=11.6), 5.44(1H, d, J=11.6), 6.64(1H, s), 6.68(1H, s), 7.32-7.43(3H, m), 7.50-7.53(1H, m)
466	81-82 °C
467	91-92 °C
468	2.83(1H, d, J=4.9), 3.38(3H, s), 4.47(1H, d, J=12.2), 4.88(1H, d, J=12.2), 5.14(1H, s), 6.82(1H, brs), 7.20-7.30(2H, m), 7.32-7.38(1H, m), 7.42-7.49(1H, m), 7.56(1H, d, J=1.8), 8.35(1H, d, J=1.8)
469	0.91 & 1.13(共3H每个s), 2.21(3H, s), 2.85 & 2.95(共3H每个s), 3.26 & 3.48(共2H每个m), 3.43(3H, s), 5.05(1H, d, J=12.2), 5.22(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 6.86(1H, d, J=9.1), 7.12(1H, d, J=7.3), 7.13(1H, s), 7.33-7.41(3H, m), 7.49-7.55(1H, m)
470	2.18(3H, s), 2.32(3H, s), 3.41(3H, s), 5.05(1H, d, J=11.6), 5.17(1H, s), 5.31(1H, d, J=11.6), 6.71(1H, d, J=7.3), 6.76(1H, s), 7.02(1H, d, J=7.9), 7.35-7.41(2H, m), 7.48-7.54(2H, m)
471	2.27(3H, s), 3.22(3H, s), 3.49(3H, s), 3.54(3H, s), 5.09(1H, d, J=12.2), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.72(1H, s), 6.86-6.94(2H, m), 7.15-7.20(2H, m), 7.25-7.39(3H, m), 7.56(1H, d, J=7.3)
472	110-112 °C
473	2.28(6H, s), 2.80(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 4.87(1H, d, J=12.2), 5.06(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 6.77(1H, brs), 6.98(1H, dd, J=8.5, 6.1), 7.02(2H, d, J=7.3), 7.30-7.43(3H, m), 7.60-7.63(1H, m)

## 实施例 19

(E)-2-亚苄氨基氧甲基- $\alpha$ -甲氧基-N-甲基苯乙酰胺(化合物 480)的合成

于 0 °C 搅拌 2-羟甲基- $\alpha$ -甲氧基-N-甲基苯乙酰胺(0.42g, 2.0mmol)的四氢呋喃(4ml)溶液, 加入亚硫酸氯(0.17ml, 2.4mmol)和一滴 N,N-二甲基甲酰胺。该混合物在室温下搅拌 2 小时, 并加入水。所得混合物用乙醚萃取, 饱和盐水洗涤, 无水硫酸镁干燥。蒸去溶剂得到油状粗产物(0.38g)。将苯甲醛肟(0.37g, 3.1mmol)和碳酸钾(0.55g, 4.0mmol)加到该粗产物的 N,N-二甲基甲酰胺(6ml)溶液中, 室温下将该混合物搅拌 3 天。加入水, 用乙醚萃取该混合物, 无水硫酸镁干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙酯 = 13/7)提纯, 得到所需化合物 (E)- $\alpha$ -亚苄氨基氧甲基- $\alpha$ -甲氧基-N-甲基苯乙酰胺(0.32g, 51%) 白色结晶。

mp: 75.0-75.5 °C

15

NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 2.84(3H, d, J=4.9), 3.34

(3H, s), 5.13(1H, s), 5.23(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2),

6.80(1H, brs), 7.27-7.40(6H, m), 7.41-7.48(1H, m), 7.53-

7.58(2H, m), 8.10(1H, s).

20

## 实施例 20

(E)-2-亚苄氨基氧甲基- $\alpha$ -羟基苯乙酸甲酯(化合物序号 483)的合成

将硼氢化钠(0.04g, 1.0mmol)加到 2-(2-溴甲基)苯基-2-氧代乙酸甲酯(0.51g, 2.0mmol)的甲醇(10ml)溶液中。8 分钟后加入乙酸以分解过量的试剂。加入水, 用乙酸乙酯萃取混合物, 无水硫酸钠干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙酯 = 4/1)提纯, 得到所需化合物 2-溴甲基- $\alpha$ -羟基苯乙酸甲酯(0.41g, 80%)油状物。

然后, 将苯甲醛肟(0.28g, 2.3mmol)和碳酸钾(0.43g, 3.1mmol)加到 2-溴甲基- $\alpha$ -羟基苯乙酸甲酯(0.40g, 1.5mmol)的丙酮(6ml)溶液中, 然后在室温将该混合物搅拌 18 小时。加入水, 用乙醚萃取混合物, 无水硫酸镁干燥并在减压下浓缩。残余物用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙酯

= 3/1)提纯, 得到所需的化合物(E)-2-亚苄氨基氧甲基- $\alpha$ -羟基苯乙酸甲酯(0.08g, 17%)油状物。

NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 3.74(1H, d, J=5.5), 3.75  
 5 (3H, s), 5.31(1H, d, J=12.2), 5.42(1H, d, J=12.2), 5.59  
 (1H, d, J=5.5), 7.34-7.39(6H, m), 7.41-7.50(1H, m), 7.52-7.66  
 (2H, m), 8.11(1H, s).

### 实施例 21

10 (E)-2-(2-亚苄氨基氧甲基)苯基-2-氧代乙酸甲酯的合成

将苯甲醛肟(2.13g, 17.6mmol)和碳酸钾(2.90g, 21.0mmol)加到2-(2-溴甲基)苯基-2-氧代乙酸甲酯(3.00g, 11.7mmol)的丙酮(10ml)溶液中, 室温下将该混合物搅拌7小时。加入水, 混合物用乙醚萃取, 无水硫酸镁干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙酯 = 17/3)  
 15 提纯, 得到所需化合物(E)-2-(亚苄氨基氧甲基)-2-氧代苯基乙酸甲酯(2.39g, 69%)。

NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 3.89(3H, s), 5.32  
 (1H, d, J=12.2), 5.40(1H, d, J=12.2), 7.32-7.59(8H, m), 7.70  
 20 (1H, d, J=6.7), 8.16(1H, s).

### 实施例 22

(E)- $\alpha$ -羟基-2-( $\alpha$ -甲基-4-氯亚苄氨基氧甲基)苯乙酸甲酯(化合物序号479)的合成

25 将2-溴甲基- $\alpha$ -羟基苯乙酸甲酯(30.53g, 0.118mmol)和3,4-二氢2H-吡喃(17.84g, 0.212mol)的二氯甲烷(230ml)溶液于0℃搅拌。加入对-甲苯磺酸吡啶鎓(2.96g, 0.012mol), 于室温下搅拌该混合物2小时。加入水, 用二氯甲烷萃取混合物, 无水硫酸镁干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙酯 = 17/3)提纯, 得到所需化合物, 2-溴  
 30 甲基- $\alpha$ -(四氢吡喃-2-基)苯乙酸甲酯(33.58g, 83.0%)油状物。

然后, 将2-溴甲基- $\alpha$ -(四氢吡喃-2-基)苯乙酸甲酯(4.00g, 11.7mmol)和4-氯苯乙酮肟(2.97g, 17.5mmol)在N,N-二甲基甲酰胺

(30ml)中的溶液于 0 °C 进行搅拌, 向其中加入 60 % 油状氢化钠(0.70g, 17.5mmol)。2 小时后加入水, 用 1N 盐酸将混合物 PH 值调至 7, 乙醚萃取, 无水硫酸镁干燥。蒸去溶剂得到粗产物(6.28g)

5 将粗产物溶在甲醇(35ml)中, 加入对 - 甲苯磺酸吡啶鎓(0.29g, 1.2mmol)。回流加热 30 分钟后, 减压浓缩反应混合物, 加入水。用乙醚萃取该混合物, 硫酸镁干燥, 并蒸去溶剂。残余物用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙酯 = 3/1)提纯, 得到所需化合物(E)- $\alpha$ -羟基-2-( $\alpha$ -甲基-4-氯亚苄氨基氧基)苯乙酸甲酯(2.75g, 68%)油状物。

10 NMR ( $\delta$  ppm, TMS/CDCl<sub>3</sub>): 2.23(3H,s), 3.75(3H,s),  
3.77 (1H,d,J=5.5), 5.34(1H,d,J=12.2), 5.42(1H,d,J=12.2),  
7.29-7.38(5H,m), 7.43-7.48(1H,m), 7.56(2H,d,J=8.6)。

#### 实施例 23

15 (E)- $\alpha$ -甲氧基-2-( $\alpha$ -甲基-4-氯亚苄氨基氧基)苯乙酸甲酯(化合物序号 477)的合成

在 0 °C 搅拌下将 60 % 氢化钠(0.20g, 5.0mmol)加到(E)- $\alpha$ -羟基-2-( $\alpha$ -甲基-4-氯亚苄氨基氧基)苯乙酸甲酯(1.59g, 4.6mmol)和甲基碘(1.95g, 13.7mmol)在 N,N - 二甲基甲酰胺(15ml)中的溶液中。45 分钟  
20 后加入水, 用 1N 盐酸将该混合物调至 pH 1, 乙醚萃取、饱和盐水洗涤并用无水硫酸镁干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱(正己烷/二氯甲烷 = 9/1)提纯, 得到所需化合物(E)- $\alpha$ -甲氧基-2-( $\alpha$ -甲基-4-氯亚苄氨基氧基)苯乙酸甲酯(1.19g, 72%)油状物。

25 NMR ( $\delta$  ppm, TMS/CDCl<sub>3</sub>): 2.23(3H,s), 3.39(3H,s),  
3.71 (3H,s), 5.24(1H,s), 5.27(1H,d,J=12.2),  
5.51(1H,d,J=12.2), 7.30-7.54(6H,m), 7.58(2H,d,J=8.5)。

#### 实施例 24

30 (E)- $\alpha$ -甲氧基-N-甲基-2-( $\alpha$ -甲基-4-氯亚苄氨基氧基)苯基乙酰胺(化合物序号 474)的合成

将(E)- $\alpha$ -甲氧基-2-( $\alpha$ -甲基-4-氯苄氨基氧基)苯基乙酸甲酯(0.48g, 1.3mmol)和40%甲胺-甲醇溶液(10ml)的溶液, 于80℃在密封管中搅拌15小时。将混合物冷至室温, 然后减压蒸去溶剂。加入水, 用1N盐酸将混合物pH调至1, 二氯甲烷萃取, 无水硫酸镁干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙酯=3/2)提纯, 得到所需化合物(E)- $\alpha$ -甲氧基-N-甲基-2-( $\alpha$ -甲基-4-氯苄氨基氧基)苯乙酰胺(0.41g, 86%)油状物。

NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 2.22 (3H, s), 2.83 (3H, d, J=4.9), 3.32 (3H, s), 5.13 (1H, s), 5.26 (1H, d, J=12.2), 5.66 (1H, d, J=12.2), 6.77 (1H, brs), 7.29-7.47 (6H, m), 7.57 (2H, d, J=8.5).

#### 实施例 25

(E)- $\alpha$ -甲氧基-N-甲基-2-( $\alpha$ -甲基-4-氯苄氨基氧基)苯基硫代乙酰胺(化合物序号 603)的合成

将Lawesson试剂(40mg, 0.1mmol)加到(E)- $\alpha$ -甲氧基-N-甲基-2-( $\alpha$ -甲基-4-氯苄氨基氧基)苯乙酰胺(73mg, 0.2mmol)的甲苯(3ml)溶液中, 搅拌下将该混合物于80℃下加热1.5小时。使混合物冷却至室温。加入水, 混合物用乙醚萃取, 无水硫酸镁干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙酯=4/1)得到所需化合物(E)- $\alpha$ -甲氧基-N-甲基-2-( $\alpha$ -甲基-4-氯苄氨基氧基)苯基硫代乙酰胺(50mg, 66%)油状物。

NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 2.23 (3H, s), 3.25 (3H, d, J=4.9), 3.33 (3H, s), 5.29 (1H, d, J=12.2), 5.51 (1H, s), 5.80 (1H, d, J=12.2), 7.25-7.36 (5H, m), 7.42-7.47 (1H, m), 7.58 (2H, d, J=9.2), 8.77 (1H, s).

#### 实施例 26

$\alpha$ -羟基-2-(四氢吡喃-2-基氧甲基)苯乙酸乙酯的合成

在0℃搅拌2-氧代-2-[2-(四氢吡喃-2-基氧甲基)苯基]乙酸乙酯(22.60g, 77.3mmol)的甲醇(20ml)溶液, 向其中加入硼氢化钠

(1.46g, 38.6mmol)。10 分钟后加入水(100ml), 混合物用乙酸乙酯萃取, 无水硫酸镁干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙酯 = 4/1)提纯, 得到所需化合物  $\alpha$ -羟基-2-(四氢吡喃-2-基氧甲基)苯乙酸乙酯(20.47g, 90.0%)油状物。

5 NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 1.19-1.22(3H,m), 1.50-1.73  
(6H,m), 3.52-3.57(1H,m), 3.80 and 3.87( 共 1H 每个  
d, J=5.5), 3.81-3.88(1H,m), 4.09-4.30(2H,m), 4.65 and 4.69 (共 1H 每个  
d, J=12.2), 4.69(1H,m), 4.89 and 4.92 (共 1H 每个  
d, J=12.2), 5.48(1H,m), 7.30-7.41(4H,m) .

### 实施例 27

$\alpha$ -甲氧基-2-(四氢吡喃-2-基氧甲基)苯乙酸乙酯的合成

15 将甲基碘(20.25g, 143mmol)加到  $\alpha$ -羟基-2-(四氢吡喃-2-基氧甲基)苯乙酸乙酯 ( 14.00g, 47.6mmol ) 的 N,N-二甲基甲酰胺(40ml) 溶液中, 于 0 °C 搅拌该混合物。向其中加入 60 % 油状氢化钠 (1.90g, 47.5mmol) 30 分钟后加入水(100ml), 混合物用乙醚萃取, 无水硫酸镁干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙酯 = 4/1)提纯, 得到所需化合物  $\alpha$ -甲氧基-2-(四氢吡喃-2-基氧甲基)苯乙酸乙酯  
20 (14.00g, 95.5%)油状物。

NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 1.20(3H,t, J=6.8), 1.50-  
1.90(6H,m), 3.38 and 3.39( 共 3H , 每个 s ), 3.50-3.60  
(1H,m), 3.89-3.95(1H,m), 4.10-4.30(2H,m), 4.56 and 5.01(共 1H  
25 每个 d, J=12.2), 4.62(1H,m), 4.74 and 4.84( 共 1H 每个  
d, J=12.2), 5.17 and 5.23(1H in total, each s), 7.30-  
7.51(4H,m) .

### 实施例 28

30 4-甲氧基-3-异苯并二氢吡喃-4-酮的合成

将对-甲苯磺酸吡啶鎓(0.30g)加到  $\alpha$ -甲氧基-2-(四氢吡喃-2-基氧甲基)苯乙酸乙酯(14.00g, 45.4mmol)的甲醇(50ml)溶液中, 回流下

将该混合物加热 1 小时。将混合物冷却至室温，加入水(50ml)。用二氯甲烷萃取该混合物，无水硫酸镁干燥。蒸去溶剂，残余物用正己烷/乙酸乙酯(=1/1)重结晶，得到所需化合物 4 - 甲氧基 - 3 - 异苯并二氢吡喃 - 4 - 酮(6.00g, 74.2%)白色结晶。

5

mp.: 82-86°C

NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 3.73(3H,s), 4.75(1H,s),

5.28 (1H,d,J=14.0), 5.38(1H,d,J=14.0), 7.24-7.27(1H,m),

7.37(2H,m), 7.56(1H,d,J=7.3).

10

### 实施例 29

#### 2 - 羟甲基 - $\alpha$ - 甲氧基 - N - 甲基苯乙酰胺的合成

将 40 % 甲胺 - 甲醇溶液 ( 9.80g, 126mmol ) 加至 4 - 甲氧基 - 3 - 异苯并二氢吡喃 - 4 - 酮 ( 7.50g, 42.1mmol ) 的甲醇 ( 40ml ) 溶液中，  
15 混合物在室温下搅拌 1 小时。蒸去溶剂得到所需化合物 2 - 羟甲基 -  $\alpha$  - 甲氧基 - N - 甲基苯乙酰胺 ( 8.50g, 96.5 % ) 白色结晶。

mp.: 80-82°C

NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 2.86(3H,s), 3.35(3H,s),

20

4.47 (1H,d,J=11.6), 4.88(1H,d,J=11.6), 5.08(1H,s),

6.98(1H,brs), 7.32-7.41(4H,m).

### 实施例 30

( E ) -  $\alpha$  - 甲氧基 - 2 - (  $\alpha$  - 甲基 - 4 - 氯亚苄氨基氧甲基 )  
25 苯乙酸 ( 化合物序号 637 ) 的合成

将 1N 氢氧化钠溶液 ( 10ml ) 加到 ( E ) -  $\alpha$  - 甲氧基 - 2 - (  $\alpha$  - 甲基 - 4 - 氯亚苄氨基氧甲基 ) 苯乙酸乙酯 ( 0.70g, 1.9mmol ) 的甲醇 ( 10ml ) 溶液中，于室温下将该混合物搅拌 2 小时。用 1N 盐酸将该混合物调至 pH4，用二氯甲烷萃取，并用无水硫酸镁干燥。蒸去溶剂得  
30 到所需化合物 ( E ) -  $\alpha$  - 甲氧基 - 2 - (  $\alpha$  - 甲基 - 4 - 氯亚苄氨基氧甲基 ) 苯乙酸 ( 0.50g, 77 % ) 油状物。

NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 2.20 (3H, s), 3.39 (3H, s),  
5.25 (1H, s), 5.25 (1H, d,  $J=12.2$ ), 5.52 (1H, d,  $J=12.2$ ), 7.30-  
7.57 (8H, m).

5

## 实施例 31

按照与实施例 19 - 30 中描述的相同的方法, 合成各种式 (I) 化合物。由此制得的化合物, 和它们的代表性化合物的物理数据列于下表。在这些表中, 也列出了实施例 19 ~ 30 中制得的化合物, 以及它们的物理数据。

10

在这些表中, 化合物序号 474 - 935 是 M 为 O、Q 是式 (a) 基团的式 (I) 化合物; 化合物序号 936 ~ 980 是 M 为  $\text{NR}^2$ , Q 是式 (a) 基团的式 (I) 化合物; 化合物序号 981 ~ 1010 是 Q 是式 (b) 基团的式 (I) 化合物。

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
474	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
475	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
476	H	OCH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
477	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
478	H	OH	NH <sub>2</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
479	H	OH	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
480	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	H	苯基
481	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	H	苯基
482	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	H	苯基
483	H	OH	OCH <sub>3</sub>	O	1	H	苯基
484	H	OCH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	O	1	H	苯基
485	H	OH	NH <sub>2</sub>	O	1	H	苯基
486	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	苯基
487	H	OCH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	苯基
488	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
489	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	苯基
490	H	OH	NH <sub>2</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	苯基
491	H	OH	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	苯基
492	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
493	H	OCH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
494	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
495	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
496	H	OH	NH <sub>2</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
497	H	OH	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
498	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
499	H	OCH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
500	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
501	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
502	H	OH	NH <sub>2</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
503	H	OH	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
504	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -苯基
505	H	OCH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -苯基
506	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -苯基
507	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -苯基
508	H	OH	NH <sub>2</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -苯基
509	H	OH	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
510	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-Cl-苯基
511	H	OH	NH <sub>2</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-Cl-苯基
512	H	OH	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-Cl-苯基
513	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-Cl-苯基
514	H	OCH <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-Cl-苯基
515	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-Cl-苯基
516	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-Cl-苯基
517	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-Cl-苯基
518	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-Cl-苯基
519	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub> -苯基
520	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub> -苯基
521	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub> -苯基
522	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -苯基
523	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -苯基
524	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -苯基
525	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
526	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
527	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
528	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-NO <sub>2</sub> -苯基
529	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-NO <sub>2</sub> -苯基
530	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-NO <sub>2</sub> -苯基

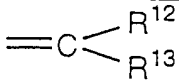


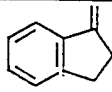
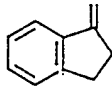
化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
5 3 1	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> -苯基
5 3 2	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> -苯基
5 3 3	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> -苯基
5 3 4	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> -苯基
5 3 5	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> -苯基
5 3 6	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> -苯基
5 3 7	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CN-苯基
5 3 8	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CN-苯基
5 3 9	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CN-苯基
5 4 0	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-苯基
5 4 1	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-苯基
5 4 2	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-苯基
5 4 3	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
5 4 4	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
5 4 5	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
5 4 6	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
5 4 7	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
5 4 8	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
5 4 9	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub> , C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> EZ 混合物	
5 5 0	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub> , C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> EZ 混合物	
5 5 1	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub> , C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> EZ 混合物	

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
5 5 2	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-OCH <sub>3</sub> -苯基
5 5 3	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-OCH <sub>3</sub> -苯基
5 5 4	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-OCH <sub>3</sub> -苯基
5 5 5	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-OCH <sub>3</sub> -苯基
5 5 6	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-OCH <sub>3</sub> -苯基
5 5 7	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-OCH <sub>3</sub> -苯基
5 5 8	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
5 5 9	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
5 6 0	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
5 6 1	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub> -苯基
5 6 2	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub> -苯基
5 6 3	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub> -苯基
5 6 4	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -苯基
5 6 5	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -苯基
5 6 6	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -苯基
5 6 7	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-Cl-4-CH <sub>3</sub> -苯基
5 6 8	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-Cl-4-CH <sub>3</sub> -苯基
5 6 9	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-Cl-4-CH <sub>3</sub> -苯基
5 7 0	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	COCH <sub>3</sub>
5 7 1	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	COCH <sub>3</sub>
5 7 2	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	COCH <sub>3</sub>

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
573	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	CO-苯基
574	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	CO-苯基
575	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	CO-苯基
576	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-联苯基
577	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-联苯基
578	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-联苯基
579	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	1-萘基
580	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	1-萘基
581	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	1-萘基
582	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-呋喃基
583	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-呋喃基
584	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-呋喃基
585	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-噻吩基
586	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-噻吩基
587	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-噻吩基
588	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-吡啶基
589	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-吡啶基
590	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-吡啶基
591	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-吡嗪基
592	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-吡嗪基
593	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-吡嗪基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
594	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-嘧啶基
595	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-嘧啶基
596	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-嘧啶基
597	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基
598	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基
599	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基
600	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -嘧啶-2-基
601	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -嘧啶-2-基
602	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -嘧啶-2-基
603	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
604	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CF <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
605	H	OCHF <sub>2</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CF <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
606	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
607	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
608	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
609	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
610	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
611	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
612	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
613	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
614	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
6 1 5	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
6 1 6	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
6 1 7	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
6 1 8	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
6 1 9	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
6 2 0	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
6 2 1	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	4-Cl-苯基
6 2 2	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	4-Cl-苯基
6 2 3	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	4-Cl-苯基
6 2 4	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
6 2 5	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
6 2 6	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	
6 2 7	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	
6 2 8	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	
6 2 9	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	
6 3 0	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
6 3 1	H	OCH <sub>3</sub>	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
6 3 2	H	OCH <sub>3</sub>	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
6 3 3	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
6 3 4	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
6 3 5	H	OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
6 3 6	H	OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
6 3 7	H	OCH <sub>3</sub>	OH	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
6 3 8	H	OCH <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
6 3 9	H	OCOCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
6 4 0	H	OTHP	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
6 4 1	H	OTHP	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
6 4 2	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Cl-苯基
6 4 3	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl-苯基
6 4 4	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-CH <sub>3</sub> -苯基
6 4 5	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-CH <sub>3</sub> -苯基
6 4 6	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-OCH <sub>3</sub> -苯基
6 4 7	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-OCH <sub>3</sub> -苯基
6 4 8	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	2	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
6 4 9	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	2	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
6 5 0	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	2	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
6 5 1	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	2	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
6 5 2	5-Cl	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
6 5 3	5-CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
6 5 4	5-OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
6 5 5	5-Cl	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
6 5 6	5-CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
6 5 7	5-OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
6 5 8	5-Cl	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-吡啶基
6 5 9	5-CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-吡啶基
6 6 0	5-OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-吡啶基
6 6 1	5-Cl	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-吡嗪基
6 6 2	5-CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-吡嗪基
6 6 3	5-OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-吡嗪基
6 6 4	5-Cl	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
6 6 5	5-CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
6 6 6	5-OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
6 6 7	5-Cl	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
6 6 8	5-CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
6 6 9	5-OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
6 7 0	H	OH	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub> , C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	EZ 混合物
6 7 1	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub> , C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	EZ 混合物
6 7 2	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub> , C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	EZ 混合物

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
673	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-Cl-4-OCH <sub>3</sub> -苯基
674	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-Cl-4-OCH <sub>3</sub> -苯基
675	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-Cl-4-CH <sub>3</sub> -苯基
676	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-Cl-4-CH <sub>3</sub> -苯基
677	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-Cl-4-OCH <sub>3</sub> -苯基
678	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-Cl-4-OCH <sub>3</sub> -苯基
679	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> -4-Cl-苯基
680	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> -4-Cl-苯基
681	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub> -苯基
682	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCHF <sub>2</sub> -苯基
683	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
684	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3,4-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
685	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2,5-(OCH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
686	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
687	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
688	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-苯氧基苯基
689	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-F-4-OCH <sub>3</sub> -苯基
690	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-F-4-OCH <sub>3</sub> -苯基
691	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-F-4-OCH <sub>3</sub> -苯基
692	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-F-4-OCH <sub>3</sub> -苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
693	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	H	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
694	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	H	4-CH <sub>3</sub> -苯基
695	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	H	4-CF <sub>3</sub> -苯基
696	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-Br-苯基
697	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-Br-苯基
698	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Br-苯基
699	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-F-苯基
700	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-F-苯基
701	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-F-苯基
702	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -苯基
703	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -苯基
704	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OC <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -苯基
705	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub> -苯基
706	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>2</sub> C≡CH-苯基
707	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -苯基
708	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub> -苯基
709	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> -苯基
710	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -苯基
711	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2,3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -苯基
712	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3,4,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> -苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
7 1 3	H	OCH <sub>3</sub>	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-F-苯基
7 1 4	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-F-苯基
7 1 5	H	OCH <sub>3</sub>	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Br-苯基
7 1 6	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Br-苯基
7 1 7	H	OCH <sub>3</sub>	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
7 1 8	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
7 1 9	H	OCH <sub>3</sub>	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
7 2 0	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
7 2 1	H	OCH <sub>3</sub>	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
7 2 2	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
7 2 3	H	OCH <sub>3</sub>	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
7 2 4	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
7 2 5	H	OCH <sub>3</sub>	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
7 2 6	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
7 2 7	H	OCH <sub>3</sub>	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
7 2 8	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
7 2 9	H	OCH <sub>3</sub>	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -苯基
7 3 0	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -苯基
7 3 1	H	OCH <sub>3</sub>	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -苯基
7 3 2	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
733	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	4-Cl-苯基
734	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	2-噻吩基	CH <sub>3</sub>
735	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	2-噻吩基	CH <sub>3</sub>
736	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	4-Cl-苯基
737	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	苯基
738	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	苯基
739	H	OCH <sub>3</sub>	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-苯基
740	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
741	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
742	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -苯基
743	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-OCH <sub>3</sub> -4-CH <sub>3</sub> -苯基
744	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-Cl-4-OCH <sub>3</sub> -苯基
745	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
746	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
747	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -苯基
748	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-OCH <sub>3</sub> -4-CH <sub>3</sub> -苯基
749	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	2,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
750	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
751	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	2-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -苯基
752	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	2-OCH <sub>3</sub> -4-CH <sub>3</sub> -苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
753	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
754	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
755	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
756	H	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
757	H	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
758	H	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
759	H	OC <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
760	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
761	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	4-Cl-苯基
762	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
763	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
764	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
765	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
766	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
767	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
768	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
769	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-苯基
770	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
771	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
772	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基

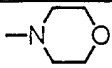
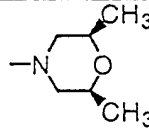
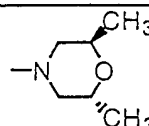
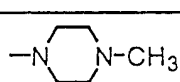
化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
773	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
774	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
775	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
776	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	CH <sub>3</sub>	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
777	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
778	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
779	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	CH <sub>3</sub>	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
780	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
781	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -苯基
782	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -苯基
783	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -苯基
784	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	CH <sub>3</sub>	3-CH <sub>3</sub> -4-OCH <sub>3</sub> -苯基
785	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-萘基
786	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-萘基
787	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	CH <sub>3</sub>	2-萘基
788	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	2-萘基
789	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-苯基
790	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
791	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
792	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基

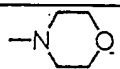
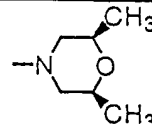
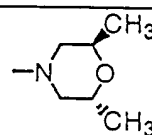
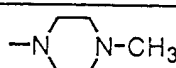
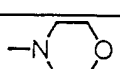
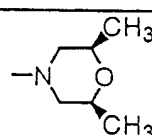
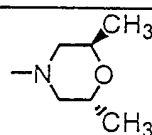
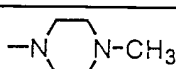
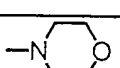
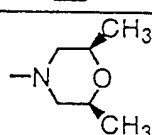
化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
793	H	Cl	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
794	H	SCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
795	H	SCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-苯基
796	H	NHCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
797	H	SCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
798	H	NHCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
799	H	SCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -苯基
800	H	NHCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -苯基
801	H	SCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
802	H	NHCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
803	H	SCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
804	H	NHCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
805	H	SCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCHF <sub>2</sub> -苯基
806	H	NHCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-OCHF <sub>2</sub> -苯基
807	H	Cl	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-NO <sub>2</sub> -苯基
808	H	SCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	4-NO <sub>2</sub> -苯基
809	H	SCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
810	H	NHCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
811	H	SCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub> -苯基
812	H	NHCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub> -苯基

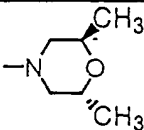
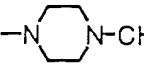
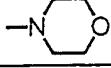
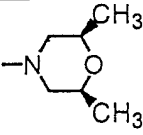
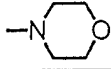
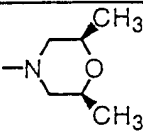
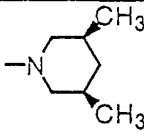
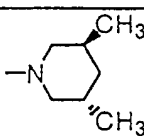
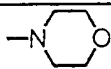
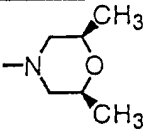
化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
8 1 3	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
8 1 4	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
8 1 5	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-苯基
8 1 6	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	4-Cl-苯基
8 1 7	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
8 1 8	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	SCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
8 1 9	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
8 2 0	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
8 2 1	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
8 2 2	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
8 2 3	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	SCH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
8 2 4	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
8 2 5	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
8 2 6	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
8 2 7	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	SCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
8 2 8	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
8 2 9	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -苯基
8 3 0	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -苯基
8 3 1	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-CF <sub>3</sub> -苯基
8 3 2	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	SCH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -苯基

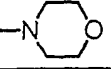
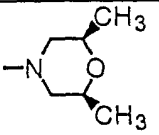
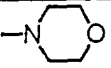
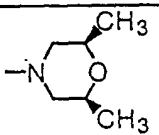
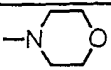
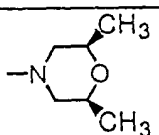
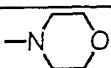
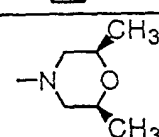
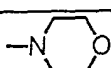
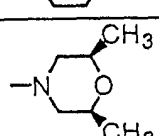
化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
8 3 3	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SOCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
8 3 4	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
8 3 5	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SOC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-苯基
8 3 6	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-苯基
8 3 7	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
8 3 8	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	SCH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
8 3 9	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
8 4 0	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
8 4 1	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-OCHF <sub>2</sub> -苯基
8 4 2	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OCHF <sub>2</sub> -苯基
8 4 3	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	SCH <sub>3</sub>	4-OCHF <sub>2</sub> -苯基
8 4 4	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-OCHF <sub>2</sub> -苯基
8 4 5	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	3-Cl-苯基
8 4 6	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Cl-苯基
8 4 7	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	2-Cl-苯基
8 4 8	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	2-Cl-苯基
8 4 9	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -苯基
8 5 0	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -苯基
8 5 1	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -苯基
8 5 2	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
8 5 3	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
8 5 4	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
8 5 5	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	3-Cl-4-OCH <sub>3</sub> -苯基
8 5 6	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-Cl-4-OCH <sub>3</sub> -苯基
8 5 7	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub> -苯基
8 5 8	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub> -苯基
8 5 9	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-NO <sub>2</sub> -苯基
8 6 0	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4-NO <sub>2</sub> -苯基
8 6 1	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4 - 苯氧基苯基
8 6 2	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4 - 苯氧基苯基
8 6 3	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	2 - 咪喃基
8 6 4	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	2 - 噻吩基
8 6 5	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	2 - 吡啶基
8 6 6	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	3 - 吡啶基
8 6 7	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	4 - 吡啶基
8 6 8	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	2 - 哒嗪基
8 6 9	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	2 - 嘧啶基
8 7 0	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	5 - 嘧啶基
8 7 1	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	1 - 萘基
8 7 2	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	SCH <sub>3</sub>	2 - 萘基

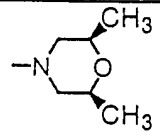
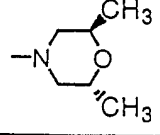
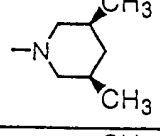
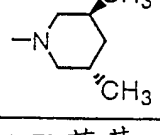
化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
873	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub> , SCH <sub>3</sub>	
874	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub> , SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
875	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub> , SC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
876	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> , SCH <sub>3</sub>	
877	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> , SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
878	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> , SC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
879	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> , SCH <sub>3</sub>	
880	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> , SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
881	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub> , SC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
882	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	
883	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	
884	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	
885	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
886	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
887	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
888	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
889	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	
890	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
891	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
892	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
893	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	
894	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CF <sub>3</sub>	
895	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CF <sub>3</sub>	

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
896	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CF <sub>3</sub>	
897	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CF <sub>3</sub>	
898	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		4-Cl-苯基
899	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		4-Cl-苯基
900	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		3-Cl-苯基
901	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		3-Cl-苯基
902	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	
903	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	
904	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		4-CH <sub>3</sub> -苯基
905	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		4-CH <sub>3</sub> -苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
906	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		4-CF <sub>3</sub> -苯基
907	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		4-CF <sub>3</sub> -苯基
908	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		3-CF <sub>3</sub> -苯基
909	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		3-CF <sub>3</sub> -苯基
910	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		4-OCH <sub>3</sub> -苯基
911	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		4-OCH <sub>3</sub> -苯基
912	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		4-OCHF <sub>2</sub> -苯基
913	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		4-OCHF <sub>2</sub> -苯基
914	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		4-NO <sub>2</sub> -苯基
915	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1		4-NO <sub>2</sub> -苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
9 1 6	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
9 1 7	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
9 1 8	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-苯基
9 1 9	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	4-Cl-苯基
9 2 0	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
9 2 1	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
9 2 2	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHCH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -苯基
9 2 3	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3-CF <sub>3</sub> -苯基
9 2 4	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	NHCH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
9 2 5	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
9 2 6	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHCH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
9 2 7	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
9 2 8	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHCH <sub>3</sub>	4-OCHF <sub>2</sub> -苯基
9 2 9	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OCHF <sub>2</sub> -苯基
9 3 0	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHCH <sub>3</sub>	4-NO <sub>2</sub> -苯基
9 3 1	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-NO <sub>2</sub> -苯基
9 3 2	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHCH <sub>3</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
9 3 3	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
9 3 4	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHCH <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub> -苯基
9 3 5	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub> -苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>2</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
936	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
937	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
938	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
939	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
940	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
941	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
942	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
943	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
944	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CO-phenyl	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
945	H	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
946	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-Cl-苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>2</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
947	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
948	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
949	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
950	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
951	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
952	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
953	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
954	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
955	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
956	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
957	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
958	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
959	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
960	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
961	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
962	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
963	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	R <sup>2</sup>	R <sup>12</sup>	R <sup>13</sup>
964	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
965	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
966	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
967	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub> -苯基
968	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3,4-Cl <sub>2</sub> -苯基
969	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -苯基
970	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-OCHF <sub>2</sub> -苯基
971	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-苯氧基苯基
972	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
973	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
974	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	COCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
975	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	CO-苯基	4-Cl-苯基
976	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
977	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	S	1	COCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
978	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
979	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
980	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	COCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	M	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
981	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
982	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	环丙基	4-Cl-苯基
983	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
984	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	环丙基	4-Cl-苯基
985	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	SCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
986	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	苯基	4-Cl-苯基
987	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NH	环丙基	4-Cl-苯基
988	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	S	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
989	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	S	环丙基	4-Cl-苯基
990	H	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	O	1	S	SCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
991	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	O	1	S	CH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
992	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	O	1	S	环丙基	4-Cl-苯基
993	H	OCH <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	O	1	S	SCH <sub>3</sub>	4-Cl-苯基
994	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
995	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	环丙基	4-CH <sub>3</sub> -苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	M	R <sup>14</sup>	R <sup>15</sup>
996	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	SCH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> -苯基
997	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
998	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	环丙基	4-CF <sub>3</sub> -苯基
999	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	SCH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -苯基
1000	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	CH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
1001	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	环丙基	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
1002	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	SCH <sub>3</sub>	4-OCH <sub>3</sub> -苯基
1003	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
1004	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	环丙基	CH <sub>3</sub>
1005	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
1006	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	CH <sub>3</sub>	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
1007	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	环丙基	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
1008	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	SCH <sub>3</sub>	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
1009	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	环丙基	4-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub> -苯基
1010	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	环丙基	4-苯氧基苯基

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	M	Q
1011	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>
1012	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl
1013	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1014	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1015	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1016	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	苄基
1017	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	2-CH <sub>3</sub> -苄基
1018	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	3-CH <sub>3</sub> -苄基
1019	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	4-CH <sub>3</sub> -苄基
1020	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	乙氧苄基
1021	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	苄基
1022	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NH	苄基
1023	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	3-吡啶基甲基
1024	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
1025	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	CH <sub>2</sub> CH=CCl <sub>2</sub>

化合物 序号	X	R <sup>1</sup>	Y	Z	n	M	Q
1026	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	CH <sub>2</sub> CH=CH-苯基
1027	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	CH <sub>2</sub> C≡CH
1028	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	CH <sub>2</sub> C≡C-CH <sub>3</sub>
1029	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	CH <sub>2</sub> C≡C-苯基
1030	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	苯甲酰基
1031	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	4-Cl-苯甲酰基
1032	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	4-CH <sub>3</sub> -苯甲酰基
1033	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	4-CF <sub>3</sub> -苯甲酰基
1034	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	4-OCH <sub>3</sub> -苯甲酰基
1035	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	CO-苄基
1036	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	S	CO-苄基
1037	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NH	CO-苄基
1038	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	4-甲苯磺酰基
1039	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	O	苯甲磺酰基
1040	H	OCH <sub>3</sub>	NHCH <sub>3</sub>	O	1	NH	4-甲苯磺酰基

化合物 序号	物理数据
474	84-87℃
475	105-106℃
476	117-118℃
477	2.23(3H, s), 3.39(3H, s), 3.71(3H, s), 5.24(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.51(1H, d, J=12.2), 7.30-7.54(6H, m), 7.58(2H, m)
478	120-122℃
479	2.23(3H, s), 3.75(3H, s), 3.77(1H, d, J=5.5), 5.34(1H, d, J=12.2), 5.42(1H, d, J=12.2), 7.29-7.38 (5H, m), 7.43-7.48 (1H, m), 7.56 (2H, d, J=8.6)
480	2.84(3H, d, J=4.9), 3.34(3H, s), 5.13(1H, s), 5.23(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.27-7.40(6H, m), 7.41-7.48(1H, m), 7.53-7.58(2H, m), 8.10(1H, s)
481	2.80(3H, d, J=4.9), 4.66(1H, brs), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.41(1H, d, J=12.2), 5.42(1H, s), 6.60(1H, brs), 7.32-7.57(9H, m), 8.06(1H, s)
482	3.40(3H, s), 3.72(3H, s), 5.25(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.50(1H, d, J=12.2), 7.31-7.65(9H, m), 8.12(1H, s)
483	3.74(1H, d, J=5.5), 3.75(3H, s), 5.31(1H, d, J=12.2), 5.42(1H, d, J=12.2), 5.59(1H, d, J=5.5), 7.34-7.49(6H, m), 7.41-7.50(1H, m), 7.52-7.66(2H, m), 8.11(1H, s)
484	144-145℃
486	123-125℃
487	111.5-112.5℃
488	2.26(3H, s), 3.39(3H, s), 3.71(3H, s), 5.27(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 5.52(1H, d, J=12.2), 7.32-7.40(5H, m), 7.43-7.56(2H, m), 7.61-7.69(2H, m)

化合物 序号	物理数据
4 8 9	2.24(3H, s), 2.65(3H, d, J=4.9), 4.83(1H, brs), 5.23(1H, d, J=12.2), 5.43(1H, d, J=12.2), 5.45(1H, s), 6.59(1H, brs), 7.31-7.40(6H, m), 7.44-7.48(1H, m), 7.52-7.58(2H, m)
4 9 0	9 3 - 9 4 °C
4 9 1	2.26(3H, s), 3.75(3H, S), 5.35(1H, d, J=12.2), 5.42(1H, d, J=12.2), 5.59(1H, s), 7.32-7.41(6H, m), 7.45-7.50(1H, m), 7.58-7.65(2H, m)
4 9 2	9 9 - 1 0 1 . 5 °C
4 9 3	1 4 1 . 5 - 1 4 2 . 5 °C
4 9 4	7 4 - 7 4 . 5 °C
4 9 5	2.21(3H, s), 2.68(3H, d, J=4.9), 3.82(3H, s), 4.95(1H, brs), 5.20(1H, d, J=12.2) 5.40(1H, d, J=12.2), 5.45(1H, s), 6.64(1H, brs), 6.89(2H, d, J=8.5), 7.31-7.48(4H, m), 7.50(2H, d, J=8.5)
4 9 6	2.20(3H, s), 3.82(3H, s), 5.21(1H, d, J=12.2), 5.39(1H, brs), 5.43 (1H, d, J=12.2), 5.48(1H, s), 6.79(1H, brs), 6.88(2H, d, J=8.5), 7.28- 7.46(4H, m), 7.49(2H, d, J=8.5)
4 9 7	7 2 . 5 - 7 3 . 5 °C
4 9 8	2.22(3H, s), 2.35(3H, s), 2.81(3H, d, J=5.5), 3.33(3H, s), 5.15(1H, s) 5.26(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.77(1H, brs), 7.15(2H, d, J=7.9), 7.28-7.48(4H, m), 7.52(2H, d, J=7.9)
4 9 9	1 2 2 - 1 2 3 °C
5 0 0	2.23(3H, s), 2.36(3H, s), 3.39(3H, s), 3.71(3H, s), 5.26(1H, d, J= 12.2), 5.27(1H, s), 5.38(1H, d, J=12.2), 7.16(2H, d, J=7.9), 7.32- 7.51(4H, m), 7.54(2H, d, J=7.9)
5 0 1	2.22(3H, s), 2.35(3H, s), 2.66(3H, d, J=4.9), 4.91(1H, brs), 5.21 (1H, d, J= 12.2), 5.41(1H, d, J=12.2), 5.45(1H, s), 6.62(1H, brs), 7.17 ( 2H, d, J=7.9), 7.31-7.47(6H, m)
5 0 2	1 0 5 - 1 0 6 °C

化合物 序号	物理数据
5 0 4	2.22(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.11(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.23-7.46(7H, m)
5 0 5	1 1 8 - 1 2 0 . 5 °C
5 0 6	2.22(3H, s), 3.38(3H, s), 3.71(3H, s), 5.22(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.50(1H, d, J=12.2), 7.24-7.65(7H, m)
5 0 7	2.21(3H, s), 2.66(3H, d, J=4.9), 5.23 (1H, d, J=12.2), 5.39 (1H, d, J=12.2), 5.39(1H, s), 6.55(1H, brs), 7.15-7.47(7H, m)
5 1 0	2.23(3H, s), 2.56(3H, d, J=4.9), 4.72(1H, d, J=3.1), 5.22(1H, d, J=12.2), 5.41(1H, s), 5.42(1H, d, J=12.2), 6.58-6.68(1H, m), 7.19-7.49(8H, m)
5 1 3	2.24(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.12(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 5.62(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.21-7.48(8H, m)
5 1 5	2.25(3H, s), 3.39(3H, s), 3.71(3H, s), 5.24(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.8), 5.51(1H, d, J=12.2), 7.22-7.65(8H, m)
5 1 6	2.22(3H, s), 2.72(3H, d, J=4.9), 4.62(1H, brs), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.43(1H, s), 6.48(1H, brs), 7.27-7.65(8H, m)
5 1 7	8 7 - 8 8 °C
5 1 8	2.23(3H, s), 3.40(3H, s), 3.72(3H, s), 5.24(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 5.52(1H, d, J=12.2), 7.25-7.66(8H, m)
5 2 0	2.21(3H, s), 2.80(3H, d, J=4.9), 3.31(3H, s), 5.09(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.59(1H, d, J=12.2), 6.76(1H, brs), 7.29-7.57(7H, m), 7.67(1H, d, J=7.3)
5 2 3	2.27(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.13(1H, s), 5.29(1H, d, J=12.2), 5.70(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.29-7.50(5H, m), 7.60(1H, d, J=7.9), 7.82(1H, d, J=7.9), 7.89(1H, s)

化合物 序号	物理数据
5 2 6	2.26(3H, s), 2.84(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.12(1H, s), 5.29(1H, d, J=12.2), 5.70(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.29-7.48(4H, m), 7.60(2H, d, J=7.9), 7.75(2H, d, J=7.9)
5 2 7	2.27(3H, s), 3.40(3H, s), 3.72(3H, s), 5.24(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.54(1H, d, J=12.2), 7.32-7.57(4H, m), 7.61(2H, d, J=8.5), 7.76(2H, d, J=8.5)
5 2 9	2.28(3H, s), 2.84(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.11(1H, s), 5.32(1H, d, J=12.8), 5.74(1H, d, J=12.8), 6.84(1H, brs), 7.29-7.41(3H, m), 7.42-7.47(1H, m), 7.80(2H, d, J=8.6), 8.18(2H, d, J=8.6)
5 3 2	2.19(3H, s), 2.26(3H, s), 2.76(3H, d, J=4.9), 3.31(3H, s), 5.13(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.57(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.10-7.28(4H, m), 7.29-7.38(3H, m), 7.42-7.47(1H, m)
5 3 5	2.23(3H, s), 2.36(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.14(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.76(1H, brs), 7.10-7.45(8H, m)
5 4 1	1.10(3H, t, J=7.3), 2.74(2H, q, J=7.3), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.12(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.32(2H, d, J=8.5), 7.35-7.53(4H, m), 7.56(2H, d, J=8.5)
5 4 2	1.11(3H, t, J=7.9), 2.75(2H, q, J=7.9), 3.39(3H, s), 3.71(3H, s), 5.24(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.50(1H, d, J=12.2), 7.33(2H, d, J=8.5), 7.36-7.65(4H, m), 7.57(2H, d, J=8.5)
5 4 4	1.10(3H, t, J=7.6), 2.73(2H, q, J=7.6), 3.32(3H, s), 3.81(3H, s), 5.14(1H, s), 5.24(1H, d, J=12.2), 5.61(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 6.84(2H, d, J=8.6), 7.30-7.40(3H, m), 7.45-7.50(1H, m), 7.56(2H, d, J=8.6)
5 4 7	1.86(6H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.09(1H, s), 5.11(1H, d, J=12.2), 5.43(1H, d, J=12.2), 6.72(1H, brs), 7.30-7.40(4H, m)
5 4 8	1.87(6H, s), 3.38(3H, s), 3.70(3H, s), 5.08(1H, d, J=12.2), 5.22(1H, s), 5.32(1H, d, J=12.2), 7.31-7.39(3H, m), 7.46-7.48(1H, m)
5 5 0	0.89(3H, t, J=7.3), 1.23-1.35(2H, m), 1.40-1.50(2H, m), 1.83(3H, s), 2.14 & 2.35 (共 2H, 每个 t, J=7.3), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.08(1H, s), 5.09 & 5.11 (共 1H, 每个 d, J=12.2), 5.42 & 5.43 (共 1H, 每个 d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.31-7.39(4H, m).

化合物 序号	物理数据
5 5 1	0.87-0.92(3H, m), 1.25-1.40(2H, m), 1.45-1.55(2H, m), 1.85 & 1.86 (共 3H 每个 s), 2.16 & 2.35 (共 2H, 每个 t, J=7.3), 3.37(3H, s), 3.70(3H, s), 5.07 & 5.10 (共 1H, 每个 d, J=12.2), 5.21(1H, s), 5.33 & 5.34 (1H in total, each d, J=12.2), 7.31-7.39(3H, m), 7.42-7.44(1H, m)
5 5 3	2.19(3H, s), 2.78(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 3.80(3H, s), 5.14(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.57(1H, d, J=12.2), 6.76(1H, brs), 6.87-6.95 (2H, m), 7.25-7.40(5H, m), 7.45-7.50(1H, m)
5 5 6	2.23(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 3.82(3H, s), 5.13(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.85(1H, brs), 6.90-6.92 (1H, m), 7.20-7.26(3H, m), 7.30-7.45(3H, m), 7.48-7.52(1H, m)
5 5 9	2.22(3H, s), 2.26(3H, s), 2.27(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.14(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.74-6.75(1H, m), 7.10(1H, d, J=7.9), 7.28-7.49(6H, m)
5 6 2	2.21(3H, s), 2.84(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.11(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.68(1H, d, J=12.2), 6.78-6.79(1H, m), 7.28-7.49(6H, m), 7.73(1H, brs)
5 7 1	1.93(3H, s), 2.35(3H, s), 2.85(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.50(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.79(1H, d, J=12.2), 6.82 (1H, brs), 7.29-7.43(4H, m)
5 7 2	1.94(3H, s), 2.36(3H, s), 3.39(3H, s), 3.72(3H, s), 5.15(1H, s), 5.34 (1H, d, J=12.2), 5.56(1H, d, J=12.2), 7.33-7.65(4H, m)
5 7 5	2.16(3H, s), 3.33(3H, s), 3.67(3H, s), 5.15(1H, s), 5.31(1H, d, J=12.2), 5.55(1H, d, J=12.2), 7.33-7.55(7H, m), 7.79-7.83(2H, m)
5 7 7	2.28(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.34(3H, s), 5.16(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.68(1H, d, J=12.2), 6.77(1H, brs), 7.31(7H, m), 7.57-7.62 (4H, m), 7.71(2H, d, J=8.5)
5 8 0	2.38(3H, s), 2.75(3H, d, J=4.9), 3.30(3H, s), 5.18(1H, s), 5.34(1H, d, J=12.2), 5.68(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.33-7.55(8H, m), 7.81-7.93(3H, m)
5 8 1	2.38(3H, s), 3.39(3H, s), 3.69(3H, s), 5.31(1H, s), 5.32(1H, d, J=12.2), 5.56(1H, d, J=12.2), 7.36-7.60(8H, m), 7.83-7.95(3H, m)
5 8 3	2.17(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.34(3H, s), 5.10(1H, s), 5.29(1H, d, J=12.2), 5.62(1H, d, J=12.2), 6.43(1H, dd, J=3.7, 1.8), 6.62(1H, d, J=3.7), 6.79(1H, brs), 7.28-7.47(5H, m)

化合物 序号	物理数据
5 8 4	2.18(3H, s), 3.40(3H, s), 3.71(3H, s), 5.23(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 5.52(1H, d, J=12.2), 6.44(1H, dd, J=3.7, 1.8); 6.64(1H, d, J=3.7), 7.32-7.55(5H, m)
5 8 6	2.25(3H, s), 2.84(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.13(1H, s), 5.23(1H, d, J=12.2), 5.62(1H, d, J=12.2), 6.79(1H, brs), 6.99(1H, dd, J=4.9, 3.7), 6.98-7.47(6H, m)
5 8 7	2.26(3H, s), 3.40(3H, s), 3.71(3H, s), 5.24(1H, d, J=12.2), 5.25(1H, s), 5.47(1H, d, J=12.2), 7.00(1H, dd, J=5.5, 3.7), 7.21-7.53(6H, m)
5 8 9	2.35(3H, s), 2.84(3H, d, J=5.5), 3.33(3H, s), 5.14(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.73(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.21-7.49(5H, m), 7.65(1H, dt, J=1.8, 7.9), 7.90(1H, d, J=7.9), 8.56-8.59(1H, m)
5 9 0	2.36(3H, s), 3.40(3H, s), 3.71(3H, s), 5.25(1H, s), 5.31(1H, d, J=12.2), 5.55(1H, d, J=12.2), 7.22-7.56(5H, m), 7.65(1H, dt, J=1.8, 7.9), 7.89(1H, d, J=7.9), 8.59(1H, dd, J=4.9, 1.8)
5 9 2	8 1 - 8 3 °C
5 9 3	2.33(3H, s), 3.41(3H, s), 3.73(3H, s), 5.24(1H, s), 5.35(1H, d, J=12.2), 5.58(1H, d, J=12.2), 7.32-7.56(4H, m), 8.49-8.53(2H, m), 9.15(1H, d, J=1.2)

化合物 序号	物理数据
6 0 3	2.23(3H, s), 3.25(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.29(1H, d, J=12.2), 5.51(1H, s), 5.80(1H, d, J=12.2), 7.25-7.36(5H, m), 7.42-7.47(1H, m), 7.58(2H, d, J=9.2), 8.77(1H, s)
6 0 6	1 0 5 - 1 0 7 °C
6 0 9	9 4 . 5 - 9 5 . 5 °C
6 1 0	2.27(3H, s), 3.26(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.32(1H, d, J=12.2), 5.51(1H, s), 5.84(1H, d, J=12.2), 7.27-7.48(4H, m), 7.60(2H, d, J= 7.9), 7.75(2H, d, J=7.9)
6 1 6	1.10(3H, t, J=7.6), 2.34(3H, s), 2.76(2H, q, J=7.6), 2.81(3H, d, J= 4.9), 3.32(3H, s), 5.14 (1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J= 12.2), 6.76(1H, brs), 7.14(2H, d, J=7.8), 7.30-7.40(3H, m), 7.45- 7.50(1H, m), 7.51(2H, d, J=7.8)
6 2 7	1.55-1.68(6H, m), 2.19(2H, t, J=6.1), 2.44-2.49(2H, m), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.09(1H, s), 5.10(1H, d, J=12.2), 5.42(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.28-7.42(4H, m)
6 2 8	1.55-1.69(6H, m), 2.08(2H, t, d=6.1), 2.40-2.52(2H, m), 3.38(3H, s), 3.70(3H, s), 5.07(1H, d, J=12.2), 5.22(1H, s), 5.33(1H, d, J=12.2), 7.28-7.62(4H, m)
6 2 9	1 3 7 . 5 - 1 3 8 . 5 °C
6 3 0	2.88-2.93(2H, m), 3.01-3.05(2H, m), 3.41(3H, s), 3.72(3H, s), 5.26 (1H, d, J=12.2), 5.30(1H, s), 5.49(1H, d, J=12.2), 7.24-7.37(5H, m), 7.45-7.54(2H, m), 7.69(2H, d, J=7.3)
6 3 1	1.20(3H, t, J=7.3), 2.23(3H, s), 3.39(3H, s), 4.14-4.22(2H, m), 5.22 (1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.52(1H, d, J=12.2), 7.30-7.40(4H, m), 7.41-7.43(1H, m), 7.51-7.56(1H, m), 7.58(2H, d, J=8.6)
6 3 2	1.16(3H, t, J=7.3), 2.22(3H, s), 3.28-3.32(2H, m), 3.32(3H, s), 5.10 (1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.66(1H, d, J=12.2), 6.72(1H, brs), 7.29-7.38(5H, m), 7.43-7.46(1H, m), 7.58(2H, d, J=8.6)

化合物 序号	物理数据
6 3 3	1.22-1.28(3H, m), 2.22(3H, s), 3.45-3.65(2H, m), 3.70(3H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.32(1H, s), 5.50(1H, d, J=12.2), 7.29-7.38(4H, m), 7.41-7.43(1H, m), 7.53-7.55(1H, m), 7.57(2H, d, J=8.6)
6 3 4	1.23(3H, t, J=7.3), 2.21(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.45(2H, q, J=7.3), 5.21(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.67(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.29-7.32(4H, m), 7.37-7.42(2H, m), 7.57(2H, d, J=8.6)
6 3 5	0.87(3H, t, J=7.3), 1.29-1.35(2H, m), 1.53-1.58(2H, m), 2.21(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.40(2H, t, J=7.3), 5.19(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.68(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.29-7.43(6H, m), 7.57(2H, d, J=8.6)
6 3 6	0.87(3H, t, J=7.3), 1.23-1.45(2H, m), 1.56-1.63(2H, m), 2.22(3H, s), 3.39-3.58(2H, m), 3.69(3H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.30(1H, s), 5.49(1H, d, J=12.2), 7.29-7.39(4H, m), 7.41-7.43(1H, m), 7.52-7.59(3H, m)
6 3 7	1 0 2 - 1 0 3 °C
6 3 8	2.20(3H, s), 2.83(3H, s), 3.00(3H, s), 3.46(3H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.38(1H, s), 5.45(1H, d, J=12.2), 7.30-7.35(5H, m), 7.44-7.47(1H, m), 7.58(2H, d, J=8.6)
6 3 9	2.15(3H, s), 2.22(3H, s), 2.62(3H, d, J=4.9), 5.33(1H, d, J=12.2), 5.52(1H, d, J=12.2), 6.22(1H, brs), 6.47(1H, s), 7.31(2H, d, J=8.6), 7.34-7.39(2H, m), 7.42-7.53(2H, m), 7.56(2H, d, J=8.6)

化合物序号	物理数据
671	1.06(3H, t, J=7.3), 1.84(3H, s), 2.16 & 2.35(共2H,每个q, J=7.3), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.09 & 5.11(共1H,每个d, J=12.2), 5.11(1H, s), 5.40 & 5.42(共1H,每个d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.30-7.39(4H, m)
672	1.04-1.10(3H, m), 1.84 & 1.85(3H in total, each s), 2.16 & 2.34(2H in total, each q, J=7.3), 3.38(3H, s), 3.70(3H, s), 5.07 & 5.12(1H in total, each d, J=12.2), 5.27(1H, s), 5.34 & 5.36(共1H,每个d, J=12.2), 7.30-7.38(3H, m), 7.42-7.45(1H, m)
678	2.20(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 3.91(3H, s), 5.13(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.77(1H, brs), 6.89(1H, d, J=8.5), 7.29-7.46(4H, m), 7.50(1H, dd, J=8.5, 2.4), 7.69(1H, d, J=2.4)
680	2.21(3H, s), 2.38(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.12(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.29-7.51(7H, m)
682	2.23(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.12(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.66(1H, d, J=12.2), 6.51(1H, t, J=73.8), 6.81(1H, brs), 7.08(2H, d, J=8.6), 7.30-7.39(3H, m), 7.42-7.47(1H, m), 7.63(2H, d, J=8.6)
684	2.22(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 3.89(3H, s), 3.91(3H, s), 5.14(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.76-6.78(1H, m), 6.83(1H, d, J=8.5), 7.13(1H, dd, J=8.5, 2.4), 7.29(1H, d, J=2.4), 7.29-7.49(4H, m)
686	2.18(3H, s), 2.23(3H, s), 2.30(3H, s), 2.78(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.13(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.58(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 6.97-7.47(7H, m)
688	2.22(3H, s), 2.78(3H, d, J=4.9), 3.31(3H, s), 5.14(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.66(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 6.93-7.01(4H, m), 7.10(1H, t, J=7.3), 7.28-7.39(5H, m), 7.41-7.67(1H, m), 7.60(2H, d, J=9.2)
690	2.23(3H, d, J=3.1), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 3.80(3H, s), 5.13(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.62(1H, d, J=12.2), 6.60(1H, dd, J=12.8, 2.4), 6.66(1H, dd, J=8.5, 2.4), 7.29-7.47(5H, m)
692	2.20(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 3.90(3H, s), 5.13(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.64(1H, d, J=12.2), 6.77-6.79(1H, m), 6.92(1H, t, J=8.5), 7.29-7.49(6H, m)
698	2.21(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.12(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.66(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.28-7.40(3H, m), 7.42-7.55(5H, m)

化合物 序号	物理数据
7 0 1	2.22(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.13(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.73(1H, brs), 7.00-7.05(2H, m), 7.27-7.36(3H, m), 7.43-7.45(1H, m), 7.58-7.62(2H, m)
7 0 2	1.41(3H, t, J=7.3), 2.21(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 4.05(2H, q, J=7.3), 5.15(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.62(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 6.86(2H, d, J=8.5), 7.30-7.48(4H, m), 7.56(2H, d, J=8.5)
7 0 4	0.97(3H, t, J=7.3), 1.49(2H, 六重峰 J=7.3), 1.77(2H, 五重峰, J=7.3), 2.21(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 3.97(2H, t, J=7.3), 5.15(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.62(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 6.86(2H, d, J=8.5), 7.28-7.48(4H, m), 7.56(2H, d, J=8.5)
7 0 7	1.31(9H, s), 2.23(3H, s), 2.80(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.14(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.30-7.38(5H, m), 7.42-7.47(1H, m), 7.56(2H, d, J=8.6)
7 1 0	1.22(3H, t, J=7.6), 2.22(3H, s), 2.65(2H, q, J=7.6), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.14(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.17(2H, d, J=8.6), 7.30-7.38(3H, m), 7.44-7.47(1H, m), 7.54(2H, d, J=8.6)
7 1 7	1.15(3H, t, J=7.3), 2.22(3H, s), 2.34(3H, s), 3.21-3.40(2H, m), 3.32(3H, s), 5.13(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.77(1H, brs), 7.14(2H, d, J=8.5), 7.28-7.39(3H, m), 7.44-7.48(1H, m), 7.52(2H, d, J=8.5)
7 1 8	1.19(3H, t, J=7.0), 2.21(3H, s), 2.34(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.47(2H, q, J=7.0), 5.23(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.67(1H, d, J=12.2), 6.85(1H, brs), 7.20-7.53(8H, m)

化合物 序号	物理数据
7 2 1	1.15(3H, t, J=7.3), 2.22(3H, s), 2.34(3H, s), 3.22-3.36(2H, m), 3.32(3H, s), 3.81(3H, s), 5.13(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.76(1H, brs), 6.86(2H, d, J=9.2), 7.29-7.38(3H, m), 7.43-7.48(1H, m), 7.58(2H, d, J=9.2)
7 2 2	1.18(3H, t, J=7.0), 2.20(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.48(2H, q, J=7.0), 3.81(3H, s), 5.23(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.64(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 6.87(2H, d, J=8.3), 7.29-7.46(4H, m), 7.58(2H, d, J=8.3)
7 2 5	1.16(3H, t, J=7.3), 2.26(3H, s), 3.24-3.37(2H, m), 3.33(3H, s), 5.11(1H, s), 5.29(1H, d, J=12.2), 5.71(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.29-7.40(3H, m), 7.44-7.47(1H, m), 7.59(2H, d, J=8.5), 7.75(2H, d, J=8.5)
7 2 6	8 8 ~ 9 0 °C
7 3 3	0.93(3H, t, J=7.3), 1.54(2H, 六重峰 J=7.3), 2.72(2H, t, J=7.3), 3.39(3H, s), 3.71(3H, s), 5.24(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.49(1H, d, J=12.2), 7.29-7.53(4H, m), 7.32(2H, d, J=8.5), 7.56(2H, d, J=8.5)
7 3 4	2.34(3H, s), 3.34(3H, s), 3.67(3H, s), 5.29(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.58(1H, d, J=12.2), 7.70(1H, dd, J=5.5, 3.7), 7.32-7.56(6H, m)
7 3 5	2.32(3H, s), 2.79(3H, d, J=4.9), 3.29(3H, s), 5.18(1H, s), 5.31(1H, d, J=12.2), 5.72(1H, d, J=12.2), 6.74(1H, brs), 7.05-7.08(1H, m), 7.27-7.52(6H, m)
7 3 6	0.92(3H, t, J=7.3), 1.53(2H, 六重峰 J=7.3), 2.71(2H, t, J=7.3), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.12(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.65(1H, d, J=12.2), 6.75-6.78(1H, m), 7.28-7.53(4H, m), 7.31(2H, d, J=8.5), 7.55(2H, d, J=8.5)

化合物 序号	物理数据
7 3 7	3.29(3H, s), 3.39(3H, s), 3.71(3H, s), 4.62(2H, s), 5.22(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 5.53(1H, d, J=12.2), 7.30-7.36(5H, m), 7.39-7.44(1H, m), 7.45-7.50(1H, m), 7.62-7.67(2H, m)
7 3 8	2.81(3H, d, J=4.9), 3.29(3H, s), 3.32(3H, s), 4.62(2H, s), 5.11(1H, s), 5.27(1H, d, J=12.2), 5.57(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.30-7.45(6H, m), 7.56-7.59(1H, m), 7.65-7.67(2H, m)
7 3 9	1.10(3H, t, J=7.3), 1.16(3H, t, J=7.3), 2.74(2H, q, J=7.3), 3.22-3.35(2H, m), 3.32(3H, s), 5.10(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.66(1H, d, J=12.2), 6.78(1H, brs), 7.27-7.39(3H, m), 7.31(2H, d, J=8.6), 7.42-7.47(1H, m), 7.56(2H, d, J=8.6)
7 4 0	1.11(3H, t, J=7.3), 2.76(2H, q, J=7.3), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.12(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.8), 5.65(1H, d, J=12.8), 6.51(1H, t, J=73.9), 6.77(1H, brs), 7.09(2H, d, J=8.6), 7.28-7.39(3H, m), 7.40-7.48(1H, m), 7.63(2H, d, J=8.6)
7 4 1	2.51-2.89(7H, m), 3.31 & 3.35(共 3H, 每个 s), 3.50 & 3.79(共 2H, 每个 s), 5.08-5.20(2H, m), 5.44-5.55(1H, m), 6.75(1H, brs), 7.09-7.20(4H, m), 7.25-7.45(4H, m)

化合物 序号	物理数据
7 5 6	0.89(3H, t, J=7.3), 1.56-1.63(2H, m), 2.21(3H, s), 2.84(3H, d, J=4.9), 3.36(2H, t, J=7.3), 5.20(1H, s), 5.25(1H, d, J=12.2), 5.69(1H, d, J= 12.2), 6.85(1H, brs), 7.29-7.44(6H, m), 7.58(2H, dd, J=8.6, 1.8)
7 5 7	0.88(3H, t, J=7.3), 1.56-1.63(2H, m), 2.21(3H, s), 2.34(3H, s), 2.83 (3H, d, J=4.9), 3.37(2H, t, J=7.3), 5.22(1H, s), 5.24(1H, d, J=12.2), 5.67(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 7.14(2H, d, J=8.0), 7.29-7.43(4H , m), 7.52(2H, d, J=8.0)
7 5 8	0.88(3H, t, J=7.3), 1.56-1.64(2H, m), 2.21(3H, s), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.37(2H, t, J=7.3), 3.81(3H, s), 5.22(1H, s), 5.24(1H, d, J=12.2), 5.67(1H, d, J=12.2), 6.80(1H, brs), 6.86(2H, d, J=8.3), 7.29-7.46(4H , m), 7.56(2H, d, J=8.3)
7 5 9	0.88(3H, t, J=7.3), 1.56-1.63(2H, m), 2.25(3H, s), 2.84(3H, d, J=4.9), 3.36(2H, t, J=7.3), 5.20(1H, s), 5.28(1H, d, J=12.2), 5.73(1H, d, J=12.2), 6.85(1H, brs), 7.29-7.46 (4 H, m), 7.59(2H, d, J=8.0), 7.73( 2H, d, J=8.0)
7 7 3	2.18(3H, s), 2.21(3H, s), 2.30(3H, s), 2.78(3H, d, J=4.9), 3.32(3H, s), 5.13(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.58(1H, d, J=12.2), 6.76(1H, brs), 7.00-7.08(3H, m), 7.30-7.48(4H, m)
7 7 7	2.22(3H, s), 2.32(6H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.14(1H, s) 5.28(1H, d, J=12.2), 5.64(1H, d, J=12.2), 6.77(1H, brs), 6.99(1H, s), 7.24-7.48(6H, m)
7 8 1	2.21(3H, s), 2.22(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 3.83(3H, s) 5.14(1H, s), 5.26(1H, d, J=12.2), 5.62(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 6.79(1H, d, J=8.5), 7.28-7.49(6H, m)

化合物 序号	物理数据
7 8 5	2.35(3H, s), 2.80(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 5.17(1H, s), 5.33(1H, d, J=12.2), 5.73(1H, d, J=12.2), 6.79(1H, brs), 7.29-7.40(3H, m), 7.43-7.51(3H, m), 7.78-7.86(3H, m), 7.91(1H, dd, J=8.8, 1.8), 7.97(1H, s)
8 1 3	2.05(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.34(3H, s), 5.15(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.68(1H, s, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.30-7.47(8H, m)
8 1 9	2.02(3H, s), 2.37(3H, s), 2.78(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.16(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.73(1H, brs), 7.18-7.58(8H, m)
8 2 4	2.06(3H, s), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.34(3H, s), 5.15(1H, s), 5.31(1H, d, J=12.2), 5.71(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.29-7.47(4H, m), 7.54(2H, d, J=7.9), 7.67(2H, d, J=7.9)
8 3 7	2.05(3H, s), 2.78(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 3.82(3H, s), 5.16(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 5.63(1H, d, J=12.2), 6.73(1H, brs), 6.92(2H, d, J=8.6), 7.27-7.48(6H, m)
8 7 3	2.12(3H, s), 2.32(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 5.11(1H, s), 5.17(1H, d, J=12.2), 5.51(1H, d, J=12.2), 6.74(1H, brs), 7.26-7.42(4H, m)
8 7 9	0.91(3H, t, J=7.3), 1.33(2H, sextet, J=7.3), 1.56(2H, quintet, J=7.3), 2.31(3H, s), 2.40(2H, t, J=7.3), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 5.10(1H, s), 5.18(1H, d, J=12.2), 5.50(1H, d, J=12.2), 6.73(1H, brs), 7.26-7.42(4H, m)
8 8 2	1 3 4 ~ 1 3 5 °C
8 8 3	1.18(6H, d, J=6.7), 1.95(3H, s), 2.27-2.36(2H, m), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.34(3H, s), 3.45-3.49(2H, m), 3.59-3.67(2H, m), 5.00(1H, d, J=12.2), 5.09(1H, s), 5.30(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.28-7.43(4H, m)

化合物 序号	物理数据
891	0.88(3H, t, J=7.3), 1.18(6H, d, J=6.7), 1.26-1.44(4H, m), 2.28-2.44(4H, m), 2.83(3H, d, J=4.9), 3.33(3H, s), 3.42-3.46(2H, m), 3.58-3.64(2H, m), 4.98(1H, d, J=12.2), 5.09(1H, s), 5.29(1H, d, J=12.2), 6.75(1H, brs), 7.27-7.43(4H, m)
898	2.76(3H, d, J=4.9), 2.99(4H, t, J=4.3), 3.04(3H, s), 3.68(4H, t, J=4.3), 4.90(1H, s), 4.97(1H, d, J=12.2), 5.33(1H, d, J=12.2), 6.61(1H, brs), 7.20-7.43(8H, m)
904	2.34(3H, s), 2.70(3H, d, J=4.9), 3.01(4H, t, J=4.9), 3.04(3H, s), 3.67(4H, t, J=4.9), 4.91(1H, s), 4.99(1H, d, J=12.2), 5.28(1H, d, J=12.2), 6.51(1H, brs), 7.15-7.36(8H, m)
905	1.12(6H, d, J=6.7), 2.29-2.39(2H, m), 2.35(3H, s), 2.69(3H, d, J=4.9), 3.04(3H, s), 3.22-3.30(2H, m), 3.59-3.70(2H, m), 4.90(1H, s), 4.98(1H, d, J=12.2), 5.26(1H, d, J=12.2), 6.50(1H, brs), 7.14-7.39(8H, m)
906	130 ~ 131 °C
907	1.13(6H, d, J=6.7), 2.32-2.42(2H, m), 2.77(3H, d, J=4.9), 2.98(3H, s), 3.15-3.23(2H, m), 3.59-3.71(2H, m), 4.86(1H, s), 4.96(1H, d, J=12.2), 5.34(1H, d, J=12.2), 6.64(1H, brs), 7.25-7.28(4H, m), 7.47(2H, d, J=7.9), 7.63(2H, d, J=7.9)
910	2.71(3H, d, J=4.9), 3.01(4H, t, J=4.9), 3.05(3H, s), 3.68(4H, t, J=4.9), 3.80(3H, s), 4.93(1H, s), 5.00(1H, d, J=12.2), 5.29(1H, d, J=12.2), 6.53(1H, brs), 6.87(2H, d, J=8.5), 7.23-7.39(6H, m)
911	1.12(3H, d, J=6.7), 1.13(3H, d, J=6.7), 2.28-2.38(2H, m), 2.70(3H, d, J=4.9), 3.06(3H, s), 3.22-3.27(2H, m), 3.56-3.70(2H, m), 3.81(3H, s), 4.92(1H, s), 5.00(1H, d, J=12.2), 5.28(1H, d, J=12.2), 6.52(1H, brs), 6.87(2H, d, J=9.2), 7.23-7.34(6H, m)
941	2.21(3H, s), 2.36(3H, s), 2.85(3H, d, J=4.9), 3.36(3H, s), 5.05(1H, s), 5.34(1H, d, J=12), 5.64(1H, d, J=12), 6.82(1H, brs), 7.33-7.40(5H, m), 7.48-7.50(1H, m), 7.81(2H, d, J=8.8)
982	0.72-0.74(2H, m), 1.00-1.05(2H, m), 1.61(1H, m), 2.82(3H, d, J=4.9), 3.54(3H, s), 4.26-4.31(1H, m), 4.55-4.60(1H, m), 5.07(1H, s), 6.85(1H, brs), 6.84-6.88(2H, m), 7.30-7.41(6H, m)

化合物 序号	物理数据
995	0.68-0.70(2H, m), 1.00-1.05(2H, m), 1.80-1.85(1H, m), 2.30(3H, s), 2.81(3H, d, J=4.9), 3.31(3H, s), 4.20(1H, d, J=13.0), 4.60(1H, d, J=13.0), 5.09(1H, s), 6.60(1H, brs), 6.75(2H, m), 7.00-7.20(2H, m), 7.30-7.55(4H, m)
1017	2.33(3H, s), 2.68(3H, d, J=4.9), 3.30(3H, s), 4.59(2H, s), 4.67(1H, d, J=12.0), 4.91(1H, d, J=12.0), 5.01(1H, s), 6.70(1H, brs), 7.10-7.20(2H, m), 7.29-7.41(6H, m)
1030	2.82(3H, d, J=4.9), 3.35(3H, s), 5.10(1H, s), 5.44(1H, d, J=12.8), 5.74(1H, d, J=12.8), 6.83(1H, brs), 7.30-7.58(7H, m), 8.07(2H, d, J=7.9)

2-氧代-2-[2-(四氢吡喃-2-基氧甲基)苯基]乙酸衍生物按下述参考实施例1-3所述方法合成。

#### 参考实施例1

1-溴-2-(四氢吡喃-2-基氧甲基)苯的合成

5 将对-甲苯磺酸吡啶鎓(0.30g)加到2-溴苄醇(25.00g, 0.134mol)的二氯甲烷(100ml)溶液中, 室温下搅拌该混合物。向其中加入3,4-二氢-2H-吡喃(16.86g, 0.200mol)。室温下搅拌该混合物2小时, 加入饱和碳酸氢钠水溶液(200ml)。所得混合物用二氯甲烷萃取, 并用无水硫酸镁干燥。蒸去溶剂得到所需化合物1-溴-2-(四氢吡喃

10 -2-基氧甲基)苯(36.00g, 99.3%)油状物。

NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 1.45-1.80(6H, m), 3.45-3.55  
(1H, m), 3.80-3.90(1H, m), 4.52(1H, d,  $J=15.0$ ), 4.80(1H, m), 4.90  
(1H, d,  $J=15.0$ ), 7.16(1H, t,  $J=7.3$ ), 7.31(1H, t,  $J=7.3$ ), 7.51  
15 (1H, d,  $J=7.3$ ), 7.54(1H, d,  $J=7.3$ ).

#### 参考实施例2

2-氧代-2-[2-(四氢吡喃-2-基氧甲基)苯基]乙酸乙酯的合成

将镁(2.67g, 0.110mol)和溴乙烷(0.20ml)在氮气氛下加至1-  
20 溴-2-(四氢吡喃-2-基氧甲基)苯(27.11g, 0.100mol)的四氢吡喃(50ml)溶液中, 室温下搅拌该混合物1小时制备Grignard试剂。将该Grignard试剂滴加至冷却到-78℃的草酸二乙酯(29.23g, 0.200mol)的四氢吡喃(100ml)溶液中, 于-78℃下搅拌1小时后加入水(150ml)。乙醚萃取该混合物, 无水硫酸镁干燥。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱(正己烷/乙酸乙酯=4/1)提纯, 得到所需化合物2-  
25 氧代-2-[2-(四氢吡喃-2-基氧甲基)苯基]乙酸乙酯(22.60g, 77.3%)油状物。

NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 1.38(3H, t,  $J=7.0$ ), 1.40-1.85  
(6H, m), 3.50-3.60(1H, m), 3.80-3.90(1H, m), 4.32-4.40(2H, m),  
30 4.69(1H, m), 4.85(1H, d,  $J=14.6$ ), 5.09(1H, d,  $J=14.6$ ), 7.43  
(1H, t,  $J=7.3$ ), 7.58-7.70(3H, m).

## 参考实施例 3

## 2-氧代-N-甲基-2-[2-(四氢吡喃-2-基氧甲基)苯基]乙酰胺的合成

将 40% 一乙胺-甲醇 (2.65g, 34.1mmol) 溶液加到 2-氧代-2-[2-(四氢吡喃-2-基氧甲基)苯基]乙酸乙酯 (2.00g, 6.8mmol) 的甲醇 (20ml) 溶液中, 室温下将该混合物搅拌 2 小时。蒸去溶剂, 残余物用硅胶柱色谱 (正己烷/乙酸乙酯 = 4/1) 提纯, 得到所需化合物 2-氧代-N-甲基-2-[2-(四氢吡喃-2-基氧甲基)苯基]乙酰胺 (1.30g, 69%) 油状物。

10 NMR ( $\delta$  ppm, TMS/ $\text{CDCl}_3$ ): 1.56-1.80 (6H, m), 2.96 (3H, d,  $J=5.5$ ), 3.40-3.50 (1H, m), 3.75-3.85 (1H, m), 4.60 (1H, m), 4.75 (1H, d,  $J=14.0$ ), 4.97 (1H, d,  $J=14.0$ ), 7.04 (1H, brs), 7.35-7.39 (1H, m), 7.51 (2H, m), 7.79 (1H, d,  $J=7.9$ ).

15 下述盆栽试验举例说明了叶面施用各种本发明化合物对于各种作物病害的控制效果。

## 试验方法

所有的实验 (均为了) 评估控制效果。即, 向试验作物喷洒液体样品, 并在 24 小时后用病原体给植株接种来实施该试验。将试验化合物溶解在少量的 N,N-二甲基甲酰胺中, 然后用含铺展剂的蒸馏水将该溶液稀释至 500 ppm 制得液体样品。根据下述公式计算控制百分比:

控制百分比 (%) = { (未处理区域的侵蚀斑的严重程度, 数目等 - 处理后区域的侵蚀斑的严重程度、数目) / 未处理区域侵蚀斑的严重程度、数目等}  $\times$  100

## 25 试验实施例 1

对 *Pyricularia oryzae* 的控制效果

将两周龄的水稻苗 (品种: AICHIASAHI) 移植到塑料杯中 (各杯直径 9cm), 再培育两周。将试验化合物以溶液或悬浮液形式喷撒到水稻苗的叶片上。通过向叶片上喷洒在燕麦粉中培育的 *Pyricularia oryzae* 分生孢子悬浮液来接种病原体。接种后, 将试验植株在温室 (28  $^{\circ}\text{C}$ , 100% R. H.) 中保存 24 小时, 然后在温室中放置 5 天。接种后 6 天, 测量被接种植物叶片侵蚀斑的数目来计算控制百分比。

(本发明)化合物对于 Pyricularia oryzae 显示出高的控制百分比。  
例如, 下述化合物浓度 500 ppm 时控制百分比不低于 90 %:

化合物序号: 75, 139, 140, 161, 163, 165, 166, 170, 175,

5 176, 186, 193, 194, 196, 197, 211, 212, 214, 217, 219, 221,  
223, 233, 267, 372, 423, 427, 429, 432, 448, 459, 465, 466,  
467, 472, 474, 475, 476, 477, 486, 488, 491, 492, 494, 495,  
499, 500, 501, 503, 513, 516, 517, 518, 526, 529, 532, 535,  
544, 553, 556, 559, 562, 580, 609, 616, 639, 678, 680, 682,  
10 684, 686, 688, 690, 692, 698, 701, 702, 704, 707, 710, 717,  
718, 721, 722, 725, 726, 733, 736, 739, 740, 773, 781, 785,  
813, 819, 824, 837, 883 和 982.

#### 试验实施例 2

15 对于黄瓜粉霉[苍耳单丝壳菌 ( Sphaerotheca fuliginea )]的控制效果

将黄瓜种籽(品种: TSUKUBASHIROIBO)播种在塑料杯中(每个直径 9cm), 然后培育 2 至 3 周。将溶液或悬浮液形式的液体试验样品喷到它们的第一叶片的表面。通过向叶片喷洒苍耳单丝壳菌的分生孢子悬浮液接种病原体, 该苍耳单丝壳菌是在黄瓜叶片上培育的。接种后,  
20 将植株放置在 20 °C 温室内。接种后 10 天, 观测叶片感染面积, 计算控制百分比。

(本发明)化合物对于苍耳单丝壳菌, 显示出高的控制百分比。例如, 下述化合物浓度 500 ppm 时控制百分比不低于 97 %。

化合物序号: 64, 75, 78, 113, 139, 140, 141, 142, 143, 144,

25 145, 149, 151, 152, 155, 156, 161, 165, 170, 173, 174, 176,  
179, 180, 183, 185, 186, 189, 193, 194, 195, 196, 197, 198,  
205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216,  
217, 218, 219, 221, 223, 231, 233, 262, 263, 267, 291, 292,  
30 296, 297, 362, 372, 417, 420, 423, 427, 429, 432, 433, 436,

437, 443, 448, 453, 454, 459, 461, 465, 466, 467, 468, 469,  
 472, 474, 475, 476, 477, 482, 486, 488, 489, 491, 492, 494,  
 497, 498, 500, 501, 503, 504, 506, 513, 515, 516, 517, 518,  
 520, 523, 526, 527, 529, 532, 535, 541, 542, 544, 553, 556,  
 5  
 559, 577, 580, 586, 587, 589, 590, 592, 593, 603, 606, 609,  
 616, 627, 639, 678, 680, 682, 684, 686, 688, 690, 692, 698,  
 701, 702, 704, 707, 710, 717, 718, 721, 722, 725, 726, 733,  
 734, 736, 737, 738, 739, 740, 756, 759, 773, 777, 781, 785,  
 10 813, 819, 824 和 883.

### 试验实施例 3

#### 对古巴假霜霉 (*Pseudoperonospora cubensis*) 的控制效果

将黄瓜种籽(品种: TSUKUBASHIROIBO) 种子塑料杯中(每个直径 9cm), 然后培育 2 至 3 周。将试验化合物以溶液或悬浮液形式喷到  
 15 它们的第一片叶子上, 并将在黄瓜叶片上培育的古巴假霜霉的游动孢子囊悬浮液滴至上述叶片表面来给试验植物接种病原体。接种后, 将植株放置在 20 °C 的湿室内 10 天。然后测量接种处周围侵蚀斑增大的半径, 并计算出控制百分比。

(本发明) 化合物对于古巴假霜霉显示出高的控制百分比。例如,  
 20 下述化合物浓度为 500 ppm 时控制百分比不低于 90 %:

化合物序号: 74, 113, 139, 140, 156, 161, 165, 170,  
 176, 186, 189, 193, 194, 196, 197, 206, 207, 209, 210, 212,  
 216, 217, 218, 219, 221, 223, 231, 233, 263, 267, 291, 362,  
 372, 417, 420, 423, 427, 429, 432, 433, 443, 448, 453, 459,  
 25 465, 466, 467, 468, 472, 474, 476, 477, 478, 482, 487, 488,  
 489, 491, 492, 494, 495, 496, 497, 498, 499, 500, 501, 503,  
 504, 505, 506, 507, 508, 509, 512, 513, 515, 516, 517, 518,  
 523, 526, 527, 529, 535, 541, 542, 544, 553, 556, 559, 562,  
 30 576, 580, 581, 583, 586, 587, 589, 590, 606, 609, 616, 627,  
 639, 678, 680, 682, 684, 686, 688, 690, 692, 698, 701, 702,  
 704, 707, 710, 717, 718, 721, 722, 725, 726, 733, 734, 735,

736, 737, 739, 740, 756, 757, 758, 759, 773, 777, 781, 785,  
813, 819, 824, 837, 883, 982, 995, 1016, 1019, 1030, 1031,  
1033 和 1034.

#### 5 试验实施例 4

对 Erysiphe graminis f. sp. tritici 的控制效果

将小麦(品种: NORIN No. 61)种籽播种在塑料杯中(每个杯直径 9cm), 然后培育 2 ~ 3 周。将试验化合物以溶液或悬浮液形式喷到麦苗上, 然后将小麦叶片上培育的 Erysiphe graminis f. sp. tritici 分生孢子滴到试验植株上以给植株接种病原体。接种后, 将植株在 20 °C 温室内放置。接种 10 天后, 观测叶片的感染面积, 并计算控制百分比。

(本发明)化合物对于 Erysiphe graminis f. sp. tritici 显示出高的控制百分比。例如, 下述化合物在 500 ppm 浓度时, 控制百分比不低于 90 %:

15 化合物序号: 2, 75, 113, 139, 140, 141, 142, 143,  
144, 145, 151, 152, 161, 170, 174, 175, 176, 179, 184, 185,  
186, 188, 189, 193, 194, 195, 196, 197, 198, 206, 212, 216,  
217, 218, 219, 223, 263, 297, 362, 372, 417, 420, 423, 427,  
20 429, 432, 433, 443, 448, 454, 459, 465, 466, 467, 474, 477,  
488, 492, 498, 500, 517, 518, 526, 527, 541, 542, 590, 603,  
627, 686, 701, 726, 739 和 883.

如上所述, 本发明提供了一类具有杀菌活性的新的  $\alpha$ -取代苯乙酸衍生物, 它的制备方法和中间体, 及含有该类化合物作为活性组分的农  
25 用杀菌剂。