



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 103189376 B

(45) 授权公告日 2016.02.24

(21) 申请号 201180052852.X

C07D 498/04(2006.01)

(22) 申请日 2011.08.29

C07D 513/04(2006.01)

(30) 优先权数据

C07D 231/40(2006.01)

10174905.9 2010.09.01 EP

C07D 271/08(2006.01)

C07D 277/56(2006.01)

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

C07D 333/38(2006.01)

2013.05.02

A01N 43/90(2006.01)

(86) PCT国际申请的申请数据

(56) 对比文件

PCT/EP2011/064825 2011.08.29

WO 2008/009908 A1, 2008.01.24, 权利要求

(87) PCT国际申请的公布数据

1.

W02012/028582 DE 2012.03.08

WO 2011/051212 A1, 2011.05.05, 权利要求

(73) 专利权人 拜耳知识产权有限责任公司

1, 说明书 1-5, 24-25, 28-33, 40-41 页.

地址 德国蒙海姆

WO 2008/071918 A1, 2008.06.19, 权利要求

(72) 发明人 S·莱尔 C·沃尔德拉夫

1, 16-18.

E·加茨魏勒 I·豪泽-哈恩

WO 2010/049269 A1, 2010.05.06, 权利要求

I·海涅曼 C·H·罗辛格

1, 12-15.

WO 2009/063180 A1, 2009.05.22, 权利要求

(74) 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限公司 11285

1, 9.

WO 2009/090401 A2, 2009.07.23, 权利要求

代理人 王媛 钟守期

1.

审查员 刘长娥

(51) Int. Cl.

C07D 471/04(2006.01)

C07D 495/04(2006.01)

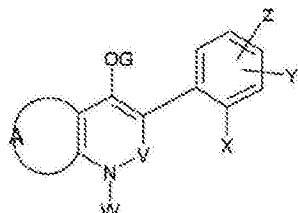
权利要求书5页 说明书159页

(54) 发明名称

具有除草活性的酮基磺内酰胺和二酮基吡啶

(57) 摘要

本发明记载了式(I)的酮基磺内酰胺和二酮基吡啶,及其作为除草剂的用途。

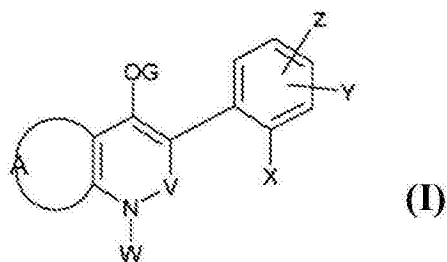


在所述式(I)中,

(I)

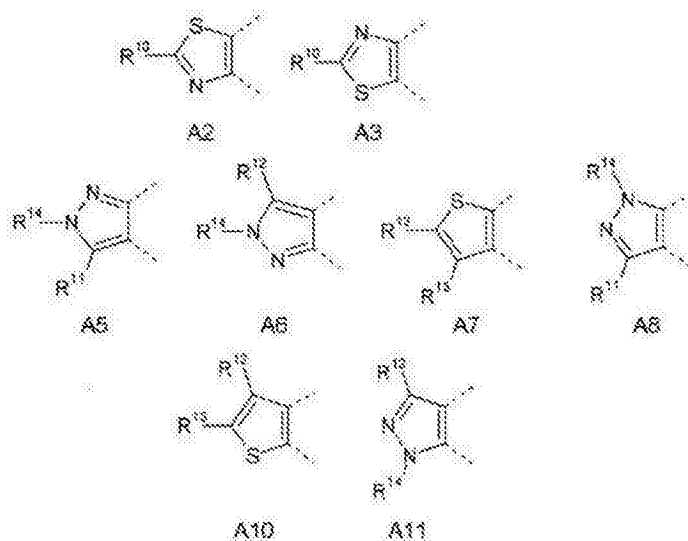
G、X、Y和Z各自为基团例如氢和有机基团(例如烷基)。W代表有机基团(例如烷基)。A代表杂环。

1. 式 (I) 的酮基磺内酰胺或二酮基吡啶或其盐,



其中

A 为如下所示的五元杂环之一, 其中虚线意为连接至相邻的吡啶或酮基磺内酰胺环的键,



V 为 $C(=O)$ 或 $S(O)_2$;

n 为 0、1、2 或 3;

G 为氢、 $C(=O)R^1$ 、 $C(=L)MR^2$ 、E 或 R^8 ;

E 为金属离子等价物或铵离子;

L 为氧或硫;

M 为氧或硫;

R^1 为被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基;

R^2 为被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基;

R^8 为被 n 个卤原子取代的 (C_2-C_6) 炔基;

W 为各自被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_3-C_6) 炔基;

X、Y 和 Z 各自独立地为氢、 (C_1-C_6) 烷基、卤素、卤代 $-(C_1-C_6)$ 烷基;

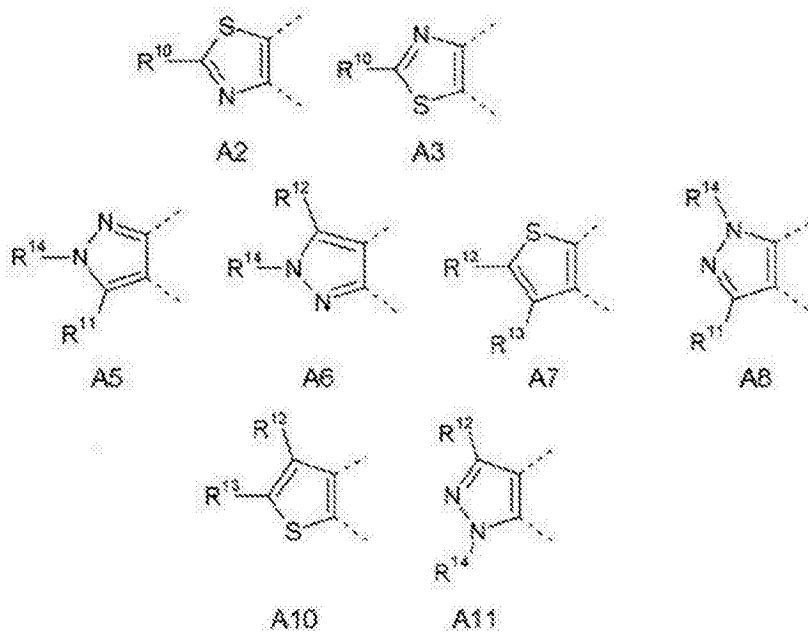
R^{10} 为氢;

R^{11} 、 R^{12} 和 R^{13} 各自独立地为氢;

R^{14} 为氢、或被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基。

2. 权利要求 1 的酮基磺内酰胺或二酮基吡啶, 其中

A 为如下所示的五元杂环之一, 其中虚线意为连接至相邻的吡啶或酮基磺内酰胺环的键,



V 为 $C(=O)$ 或 $S(O)_2$;

n 为 0、1、2 或 3;

G 为氢;

W 为各自被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_3-C_6) 炔基;

X、Y 和 Z 各自独立地为氢、 (C_1-C_6) 烷基、卤素、卤代 $-(C_1-C_6)$ 烷基;

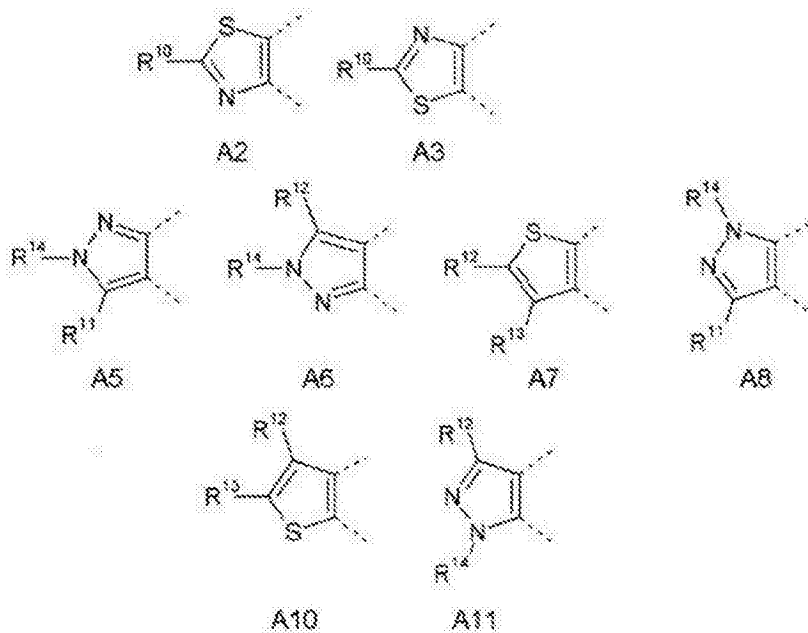
R^{10} 为氢;

R^{11} 、 R^{12} 和 R^{13} 各自独立地为氢;

R^{14} 为氢、或被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基。

3. 权利要求 1 的酮基磺内酰胺或二酮基吡啶, 其中

A 为如下所示的五元杂环之一, 其中虚线意为连接至相邻的吡啶或酮基磺内酰胺环的键,



V 为 $C(=O)$ 或 $S(O)_2$;

n 为 0、1、2 或 3；

G 为 $C(=O)R^1$ ；

R^1 为被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基；

W 为各自被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_3-C_6) 炔基；

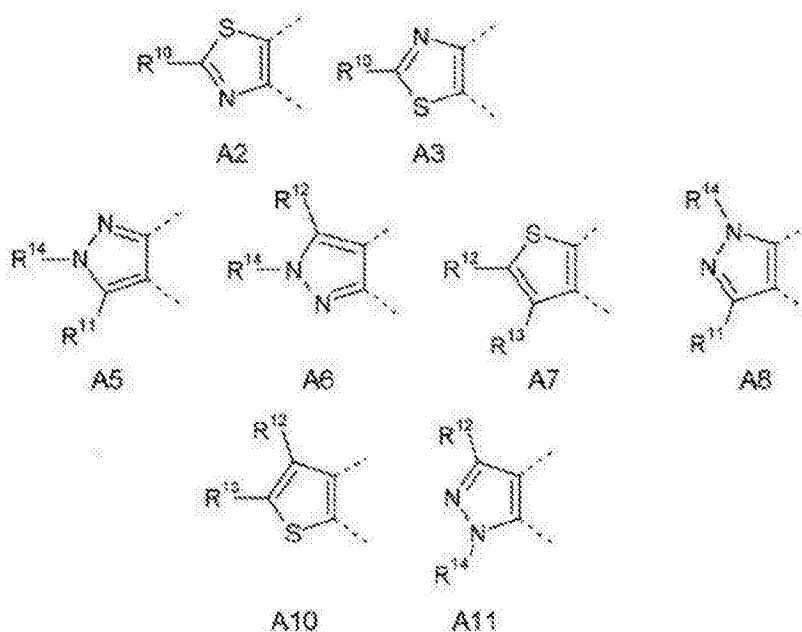
R^{10} 为氢；

R^{11} 、 R^{12} 和 R^{13} 各自独立地为氢；

R^{14} 为氢、或被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基。

4. 权利要求 1 的酮基磺内酰胺或二酮基吡啶，其中

A 为如下所示的五元杂环之一，其中虚线意为连接至相邻的吡啶或酮基磺内酰胺环的键，



V 为 $C(=O)$ 或 $S(O)_2$ ；

n 为 0、1、2 或 3；

G 为 $C(=L)MR^2$ ；

L 为氧；

M 为氧或硫；

R^2 为被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基；

W 为各自被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_3-C_6) 炔基；

X、Y 和 Z 各自独立地为氢、 (C_1-C_6) 烷基、卤素、卤代 $-(C_1-C_6)$ 烷基；

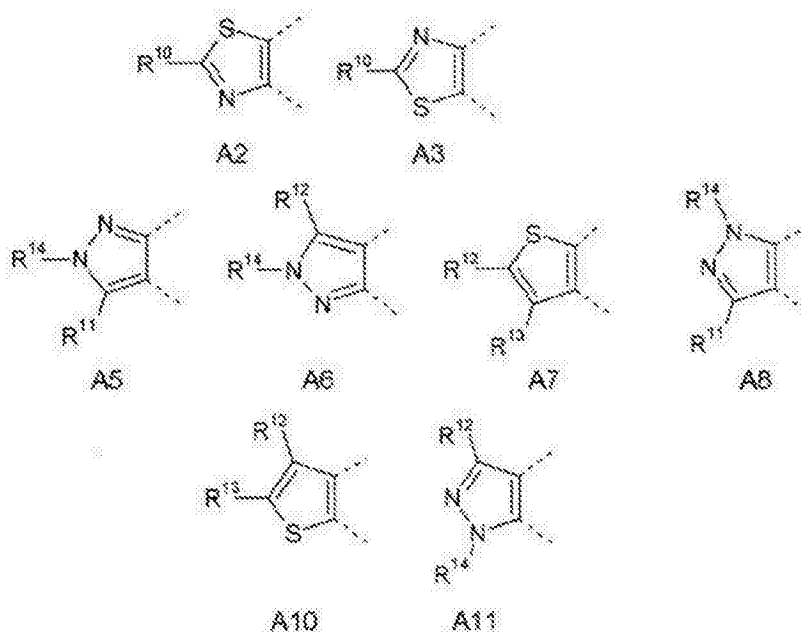
R^{10} 为氢；

R^{11} 、 R^{12} 和 R^{13} 各自独立地为氢；

R^{14} 为氢、或被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基。

5. 权利要求 1 的酮基磺内酰胺或二酮基吡啶，其中

A 为如下所示的五元杂环之一，其中虚线意为连接至相邻的吡啶或酮基磺内酰胺环的键，



V 为 C(=O) 或 S(O)₂;

n 为 0、1、2 或 3;

G 为 R⁸;

R⁸ 为被 n 个卤原子取代的 (C₂-C₆) 炔基;

W 为各自被 n 个卤原子取代的 (C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₃-C₆) 炔基;

X、Y 和 Z 各自独立地为氢、(C₁-C₆) 烷基、卤素、卤代-(C₁-C₆) 烷基;

R¹⁰ 为氢;

R¹¹、R¹² 和 R¹³ 各自独立地为氢;

R¹⁴ 为氢、或被 n 个卤原子取代的 (C₁-C₆) 烷基。

6. 一种除草剂组合物, 其特征在于包含除草活性含量的权利要求 1-5 中任一项的至少一种式 (I) 的化合物。

7. 权利要求 6 的除草剂组合物, 其为与制剂助剂的混合物。

8. 权利要求 6 或 7 的除草剂组合物, 其包含至少一种选自杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂、杀真菌剂、安全剂和生长调节剂的其它农药活性物质。

9. 权利要求 8 的除草剂组合物, 其包含一种安全剂。

10. 权利要求 8 或 9 的除草剂组合物, 其包含另一种除草剂。

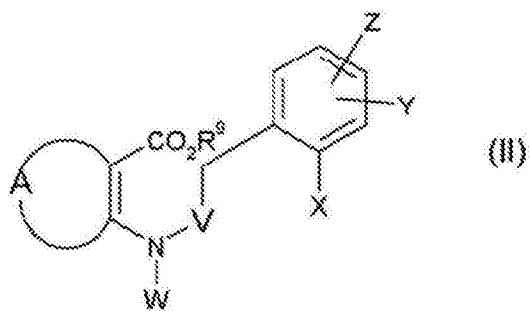
11. 一种防治不想要的植物的方法, 其包括将有效量的权利要求 1 至 5 中任一项的至少一种式 (I) 的化合物或者权利要求 6 至 10 中任一项的除草剂组合物施用于植物或者不想要的植物生长的位置。

12. 权利要求 1 至 5 中任一项的式 (I) 的化合物或者权利要求 6 至 10 中任一项的除草剂组合物用于防治不想要的植物的用途。

13. 权利要求 12 的用途, 其中将所述式 (I) 的化合物用于防治有用植物的作物中的不想要的植物。

14. 权利要求 13 的用途, 其中所述有用植物为转基因有用植物。

15. 式 (II) 的化合物



其中所述取代基如权利要求 1 至 5 中任一项所定义, R⁹为 (C₁-C₆) 烷基。

具有除草活性的酮基磺内酰胺和二酮基吡啶

[0001] 本发明涉及除草剂技术领域,特别涉及用于选择性防治有用植物作物中的阔叶杂草和禾本科杂草的除草剂技术领域。

[0002] 本发明特别涉及芳基取代的酮基磺内酰胺和二酮基吡啶衍生物,涉及其制备方法以及涉及其作为除草剂的用途。

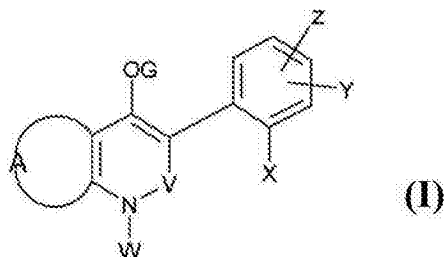
[0003] 各种文献记载了具有除草活性的二酮基吡啶,所述二酮基吡啶与6元碳环或杂环形成稠环系统。W02008/009908A1和W02008/071918A1记载了具有稠合的吡啶的二酮基吡啶。W02009/090401A1和W02010/049269A1提及稠合至吡啶环的二酮基吡啶。W02009/063180记载了稠合至吡啶环的酮基磺内酰胺。

[0004] 然而,从这些文献中已知的化合物通常显示不充分的除草效力。因此,本发明的一个目的在于提供可替代的具有除草活性的化合物。

[0005] 已经发现具有稠合的饱和或不饱和五元杂环的酮基磺内酰胺和二酮基吡啶特别适合作为除草剂。

[0006] 本发明提供式(I)的酮基磺内酰胺和二酮基吡啶,或其盐

[0007]



[0008] 其中

[0009] A为被m个选自 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 和 R^{14} 的基团取代的稠合饱和或不饱和五元杂环;

[0010] V为 $C(=O)$ 或 $S(O)_2$;

[0011] m为0、1或2;

[0012] n为0、1、2或3;

[0013] G为氢、 $C(=O)R^1$ 、 $C(=L)MR^2$ 、 SO_2R^3 、 $P(=L)R^4R^5$ 、 $C(=L)NR^6R^7$ 、E或 R^8 ;

[0014] E为金属离子等价物或铵离子;

[0015] L为氧或硫;

[0016] M为氧或硫;

[0017] R^1 为各自被n个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、二- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基或 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_6) 烷基,

[0018] 由3至5个碳原子与1至3个选自氧、硫和氮的杂原子组成的完全饱和的3元至6元环,所述环被n个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基的基团取代,

[0019] (C_3-C_6) 环烷基、苯基、苯基- (C_1-C_4) 烷基、苯氧基- (C_1-C_4) 烷基或杂芳氧基- (C_1-C_4) 烷基,所述基团被n个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基取代;

[0020] R^2 为各自被n个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基或二- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基,

[0021] 或(C₃-C₆)环烷基、苯基或苯甲基,所述基团在每种情况下被n个选自卤素、(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)烷氧基的基团取代;

[0022] R³、R⁴和R⁵各自独立地为各自被n个卤原子取代的(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷氧基、N-(C₁-C₆)烷基氨基、N,N-二-(C₁-C₆)烷基氨基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₂-C₄)烯基或(C₃-C₆)环烷硫基,

[0023] 或为苯基、苯甲基、苯氧基或苯硫基,所述基团被n个选自卤素、(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)烷氧基取代;

[0024] R⁶和R⁷各自独立地为氢、

[0025] 被n个卤原子取代的(C₁-C₆)烷基、(C₃-C₆)环烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₁-C₆)烷氧基或(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基,

[0026] 苯基或苯甲基,所述基团在每种情况下被n个选自卤素、(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)烷氧基的基团取代,

[0027] 或R⁶和R⁷一起与它们所键连的氮原子形成3元至6元环,所述环含有2-5个碳原子和0或1个氧或硫原子;

[0028] R⁸为被n个卤原子取代的(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷硫基-(C₁-C₄)烷基或二-(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基,

[0029] 被n个选自卤素、(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)烷氧基的基团取代的(C₃-C₆)环烷基,

[0030] 由3-5个碳原子和1-3个选自氧、硫和氮的杂原子组成的完全饱和的3元至6元环,所述环被n个选自卤素、(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)烷氧基的基团取代,

[0031] 苯基、苯基-(C₁-C₄)烷基、杂芳基、苯氧基-(C₁-C₄)烷基或杂芳氧基-(C₁-C₄)烷基,所述基团被n个选自卤素、(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)烷氧基的基团取代;

[0032] R¹⁰为氢、或被n个卤原子取代的(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)烷基亚磺酰基或(C₁-C₄)烷基磺酰基;

[0033] R¹¹、R¹²和R¹³各自独立地为氢、卤素、或被n个卤原子取代的(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷硫基-(C₁-C₄)烷基、二-(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)烷基亚磺酰基或(C₁-C₄)烷基磺酰基,或被n个选自卤素、(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)烷氧基的基团取代的(C₃-C₆)环烷基;

[0034] R¹⁴为氢、或被n个卤原子取代的(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷硫基-(C₁-C₄)烷基或二-(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基,或为(C₁-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)烷氧基羰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基,或

[0035] (C₃-C₆)环烷基、(C₃-C₆)环烷基羰基、(C₃-C₆)环烷氧基羰基、(C₃-C₆)环烷基磺酰基,所述基团被n个选自卤素、(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)烷氧基的基团取代;

[0036] W为各自被n个卤原子取代的(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₃-C₆)炔基、(C₃-C₆)环烷基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、二-(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷硫基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷基磺酰基-(C₁-C₆)烷基或(C₃-C₆)环烷基-(C₁-C₆)烷基,并且

[0037] X、Y和Z各自独立地为氢、(C₁-C₆)烷基、(C₃-C₆)环烷基、卤素、氰基、硝基、卤代-(C₁-C₆)烷基、卤代-(C₁-C₆)烷氧基、(C₃-C₆)环烷基、(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、卤代-(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基。

[0038] 烷基表示具有 1-8 个碳原子的饱和直链或支链的烃基,例如 C_1 - C_8 烷基(例如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基和 1-乙基-2-甲基-丙基)。

[0039] 卤烷基表示具有 1-8 个碳原子的直链或支链的烷基,其中在这些基团中的某些或所有氢原子可以由卤原子取代,例如 C_1 - C_8 卤烷基(例如氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基和 1,1,1-三氟丙-2-基)。

[0040] 烯基表示具有 2-8 个碳原子及在任意位置具有一个双键的不饱和直链或支链的烃基,例如 C_2 - C_8 烯基(例如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、3,3-二甲基-2-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基和 1-乙基-2-甲基-2-丙烯基)。

[0041] 炔基表示具有 2-8 个碳原子并且在任意位置具有一个三键的直链或支链的烃基,例如 C_2 - C_8 炔基(例如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基(或炔丙基)、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、3-甲基-1-丁炔基、1-甲基-2-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、3-甲基-1-戊炔基、4-甲基-1-戊炔基、1-甲基-2-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基和

1-乙基-1-甲基-2-丙炔基)。

[0042] 烷氧基表示具有 1-8 个碳原子的饱和直链或支链烷氧基,例如 C_1 - C_6 烷氧基(例如甲氧基、乙氧基、丙氧基、1-甲基乙氧基、丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基、1,1-二甲基乙氧基、戊氧基、1-甲基丁氧基、2-甲基丁氧基、3-甲基丁氧基、2,2-二甲基丙氧基、1-乙基丙氧基、己氧基、1,1-二甲基丙氧基、1,2-二甲基丙氧基、1-甲基戊氧基、2-甲基戊氧基、3-甲基戊氧基、4-甲基戊氧基、1,1-二甲基丁氧基、1,2-二甲基丁氧基、1,3-二甲基丁氧基、2,2-二甲基丁氧基、2,3-二甲基丁氧基、3,3-二甲基丁氧基、1-乙基丁氧基、2-乙基丁氧基、1,1,2-三甲基丙氧基、1,2,2-三甲基丙氧基、1-乙基-1-甲基丙氧基和 1-乙基-2-甲基丙氧基)；

[0043] 卤代烷氧基表示具有 1-8 个碳原子的直链或支链烷氧基(如上所具体指出的),其中在这些基团中的某些或所有氢原子可以被如上所具体指出的卤原子取代,例如 C_1 - C_2 卤代烷氧基(例如氯甲氧基、溴甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、1-氯乙氧基、1-溴乙氧基、1-氟乙氧基、2-氟乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基和 1,1,1-三氟丙-2-氧基)。

[0044] 烷硫基表示具有 1-8 个碳原子的饱和直链或支链的烷硫基,例如 C_1 - C_6 烷硫基(例如甲硫基、乙硫基、丙硫基、1-甲基乙硫基、丁硫基、1-甲基丙硫基、2-甲基丙硫基、1,1-二甲基乙硫基、戊硫基、1-甲基丁硫基、2-甲基丁硫基、3-甲基丁硫基、2,2-二甲基丙硫基、1-乙基丙硫基、己硫基、1,1-二甲基丙硫基、1,2-二甲基丙硫基、1-甲基戊硫基、2-甲基戊硫基、3-甲基戊硫基、4-甲基戊硫基、1,1-二甲基丁硫基、1,2-二甲基丁硫基、1,3-二甲基丁硫基、2,2-二甲基丁硫基、2,3-二甲基丁硫基、3,3-二甲基丁硫基、1-乙基丁硫基、2-乙基丁硫基、1,1,2-三甲基丙硫基、1,2,2-三甲基丙硫基、1-乙基-1-甲基丙硫基和 1-乙基-2-甲基丙硫基)；

[0045] 卤代烷硫基表示具有 1-8 个碳原子的直链或支链的烷硫基(如上所具体指出的),其中在这些基团中的某些或所有氢原子可以被如上所具体指出的卤原子取代,例如 C_1 - C_2 卤代烷硫基(例如氯甲硫基、溴甲硫基、二氯甲硫基、三氯甲硫基、氟甲硫基、二氟甲硫基、三氟甲硫基、氯氟甲硫基、二氯氟甲硫基、氯二氟甲硫基、1-氯乙硫基、1-溴乙硫基、1-氟乙硫基、2-氟乙硫基、2,2-二氟乙硫基、2,2,2-三氟乙硫基、2-氯-2-氟乙硫基、2-氯-2,2-二氟乙硫基、2,2-二氯-2-氟乙硫基、2,2,2-三氯乙硫基、五氟乙硫基)和 1,1,1-三氟丙-2-基硫基。

[0046] 杂芳基特别为 2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、1-吡咯基、2-吡咯基、3-吡咯基、3-异噁唑基、4-异噁唑基、5-异噁唑基、3-异噻唑基、4-异噻唑基、5-异噻唑基、1-吡唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、1-咪唑基、2-咪唑基、4-咪唑基、5-咪唑基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,3,4-噁二唑-2-基、1,3,4-噻二唑-2-基、1,2,4-三唑-1-基、1,2,4-三唑-3-基、1,2,4-三唑-4-基、1,2,4-三唑-5-基、1,2,3-三唑-1-基、1,2,3-三唑-2-基、1,2,3-三唑-4-基、四唑-1-基、四唑-2-基、四唑-5-基、吡啶-1-基、吡啶-2-基、吡啶-3-基、异吡啶-1-基、异吡啶-2-基、

苯并呋喃-2-基、苯并噻吩-2-基、苯并呋喃-3-基、苯并噻吩-3-基、苯并噁唑-2-基、苯并噻唑-2-基、苯并咪唑-2-基、吡唑-1-基、吡唑-2-基、吡唑-3-基、2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-哒嗪基、4-哒嗪基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、1,3,5-三嗪-2-基、1,2,4-三嗪-3-基、1,2,4-三嗪-5-基或1,2,4-三嗪-6-基。除非另有说明,所述杂芳基在每种情况下为未取代的或在每种情况下被选自下列的基团相同或不同地单取代或多取代:氟、氯、溴、碘、氰基、羟基、巯基、氨基、甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、异丁基、仲丁基、叔丁基、环丙基、1-氯环丙基、乙烯基、乙炔基、甲氧基、乙氧基、异丙氧基、甲硫基、乙硫基、三氟甲硫基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、氯氟甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、三氟甲氧基、三氟甲硫基、2,2,2-三氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2-二氟-2-氯乙基、2-氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2-甲氧基乙氧基、乙酰基、丙酰基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、N-甲基氨基、N,N-二甲基氨基、N-乙基氨基、N,N-二乙基氨基、氨基羰基、甲基氨基羰基、二甲基氨基羰基、二甲基氨基甲酰氨基、甲氧基羰基氨基、甲氧基羰基氧基、乙氧基羰基氨基、乙氧基羰基氧基、甲基氨磺酰基、二甲基氨磺酰基、苯基或苯氧基。

[0047] 饱和或不饱和的五元杂环应理解为意指五元环系统,其除碳原子外含有1-4个选自氧、硫和氮的杂原子。此类杂环的实例为呋喃、噻吩、1,2-噁唑、1,3-噁唑、1,2-噻唑、1,3-噻唑(thiazole)、咪唑、吡唑、1,2-二唑、1,2,5-噁二唑以及各自不饱和的和部分饱和的类似物。

[0048] 还根据取代基的类型,式(I)的化合物可作为几何异构体和/或光学异构体或者以不同组合物的异构体混合物形式存在,如果合适,可用常规的方式分离所述异构体混合物。纯异构体和异构体混合物、其制备和用途,以及包含其的组合物构成本发明的主题的一部分。然而,下文中,为简便起见,总是称为式(I)化合物,但是这含义包括纯化合物和,如果合适,含有不同比例的异构体化合物的混合物。

[0049] 金属离子等价物是含有一个正电荷的金属离子,例如 Na^+ 、 K^+ 、 $(\text{Mg}^{2+})_{1/2}$ 、 $(\text{Ca}^{2+})_{1/2}$ 、 MgH^+ 、 CaH^+ 、 $(\text{Al}^{3+})_{1/3}$ 、 $(\text{Fe}^{2+})_{1/2}$ 或 $(\text{Fe}^{3+})_{1/3}$ 。

[0050] 卤素为氟、氯、溴和碘。

[0051] 如果基团被取代基团多取代,其应理解为意指该基团被提及的那些取代基团中的一个或多个相同或不同的取代基团取代。

[0052] 根据如上所定义的取代基的性质,式(I)的化合物具有酸性或碱性特性并且可与无机或有机酸或与碱或与金属离子形成盐,并且在某些情况下还可为内盐或加成物。当式(I)的化合物带有氨基、烷基氨基或其它导致碱性特性的基团时,这些化合物可与酸反应生成盐或通过合成直接获得盐。

[0053] 无机酸的实例为氢卤酸(例如氢氟酸、盐酸、氢溴酸和氢碘酸)、硫酸、磷酸和硝酸,以及酸式盐(如 NH_4SO_4 和 KHSO_4)。有用的有机酸包括,例如,甲酸、碳酸和链烷酸(如乙酸、三氟乙酸、三氯乙酸和丙酸),以及乙醇酸、硫氰酸、乳酸、丁二酸、柠檬酸、苯甲酸、肉桂酸、草酸、烷基磺酸(含有1-20个碳原子的直链或支链的烷基基团的磺酸)、芳基磺酸或芳基二磺酸(带有一个或两个磺基基团的芳香族基团例如苯基和萘基)、烷基膦酸(含有1-20个碳原子的直链或支链的烷基基团的膦酸)、芳基膦酸或芳基二膦酸(带有一个或两个膦基基团的芳香族基团,例如苯基和萘基),其中所述烷基或芳基基团可带有其它取代

基,例如对甲苯磺酸、水杨酸、对氨基水杨酸、2- 苯氧基苯甲酸、2- 乙酰氧基苯甲酸等。

[0054] 有用的金属离子特别包括第二主族元素(特别是钙和镁)、第三主族和第四主族元素(特别是铝、锡和铅)、以及第一至第八过渡族元素(特别是铬、锰、铁、钴、镍、铜、锌和其它)的离子。特别优选第四周期元素的金属离子。这些金属可以其可采取的不同价态而存在。

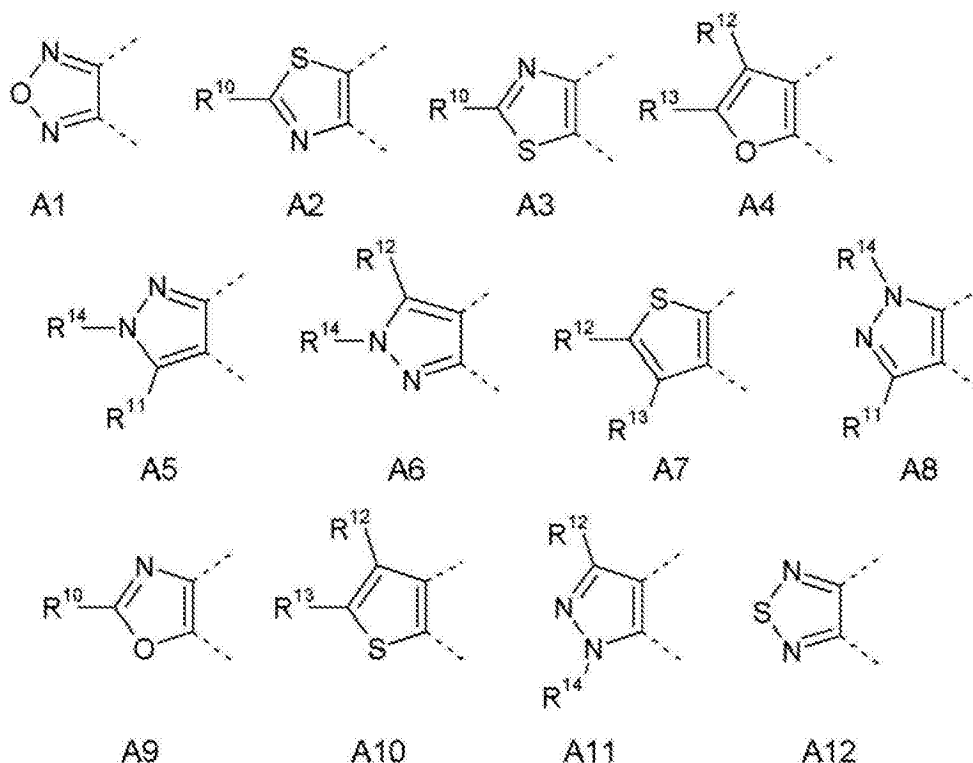
[0055] 如果式(I)的化合物带有羟基、羧基或导致酸性特性的其它基团,则这些化合物可与碱反应形成盐。合适的碱例如碱金属和碱土金属——特别是钠、钾、镁和钙——的氢氧化物、碳酸盐、碳酸氢盐,此外还有氨,带有(C₁-C₄)烷基基团的伯胺、仲胺和叔胺,(C₁-C₄)烷醇的一烷醇胺、二烷醇胺和三烷醇胺,胆碱以及氯化胆碱。

[0056] 根据所述取代基的性质和键连,式(I)的化合物可以以立体异构体存在。例如,当存在一个或多个不对称取代的碳原子或亚砷时,可以存在对映异构体或非对映异构体。立体异构体可通过常规分离方法(例如通过色谱分离方法)从制备得到的混合物中获得。还可以通过使用光学活性的原料和/或助剂使用立体选择性反应选择性制备立体异构体。本发明还涉及由式(I)所包括的但没有具体定义的所有立体异构体及其混合物。

[0057] 在下文具体指出的所有式子中,除非另外定义,所述取代基和符号具有与式(I)相同的含义。

[0058] 优选式(I)的酮基磺内酰胺和二酮基吡啶,其中A为如下所示的五元杂环A1-A12之一,其中虚线意为连接至相邻的吡啶或酮基磺内酰胺环的键,

[0059]



[0060] V 为 C(=O) 或 S(O)₂;

[0061] n 为 0、1、2 或 3;

[0062] G 为氢、C(=O)R¹、C(=L)MR²、SO₂R³、P(=L)R⁴R⁵、C(=L)NR⁶R⁷、

[0063] E 或 R⁸;

[0064] E 为金属离子等价物或铵离子；

[0065] L 为氧或硫；

[0066] M 为氧或硫；

[0067] R^1 为各自被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、二- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基或 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_6) 烷基，

[0068] 由 3 至 5 个碳原子与 1 至 3 个选自氧、硫和氮的杂原子组成的完全饱和的 3 至 6 元环，所述环被 n 个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基的基团取代，

[0069] (C_3-C_6) 环烷基、苯基、苯基- (C_1-C_4) 烷基、杂芳基、苯氧基- (C_1-C_4) 烷基或杂芳氧基- (C_1-C_4) 烷基，所述基团被 n 个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基的基团取代；

[0070] R^2 为各自被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基或二- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基，

[0071] 或 (C_3-C_6) 环烷基、苯基或苯甲基，所述基团在每种情况下被 n 个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基的基团取代；

[0072] R^3 、 R^4 和 R^5 各自独立地为被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、N- (C_1-C_6) 烷基氨基、N,N-二- (C_1-C_6) 烷基氨基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_2-C_4) 烯基或 (C_3-C_6) 环烷硫基，

[0073] 或为苯基、苯甲基、苯氧基或苯硫基，所述基团被 n 个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基取代；

[0074] R^6 和 R^7 各自独立地为氢、

[0075] 被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_1-C_6) 烷氧基或 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基，

[0076] 苯基或苯甲基，所述基团在每种情况下被 n 个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基的基团取代，

[0077] 或 R^6 和 R^7 与它们所键连的氮原子一起形成 3 元至 6 元环，所述环含有 2-5 个碳原子和 0 或 1 个氧或硫原子；

[0078] R^8 为被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基或二- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基，

[0079] 被 n 个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基的基团取代的 (C_3-C_6) 环烷基，

[0080] 由 3-5 个碳原子和 1-3 个杂原子组成的完全饱和的 3 元至 6 元环，所述杂原子选自氧、硫和氮，所述环被 n 个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基的基团取代，

[0081] 苯基、苯基- (C_1-C_4) 烷基、杂芳基、苯氧基- (C_1-C_4) 烷基或杂芳氧基- (C_1-C_4) 烷基，所述基团被 n 个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基的基团取代；

[0082] W 为各自被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_3-C_6) 炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、二- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_6) 烷基或 (C_3-C_6) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基；

[0083] X、Y 和 Z 各自独立地为氢、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、卤素、氰基、硝基、卤代- (C_1-C_6) 烷基、卤代- (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、卤代- (C_1-C_6) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基；

[0084] R^{10} 为氢、或被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基或 (C_1-C_4) 烷基磺酰基；

[0085] R^{11} 、 R^{12} 和 R^{13} 各自独立地为氢、卤素、或被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、二- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基或 (C_1-C_4) 烷基磺酰基，或被 n 个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基的基团取代的 (C_3-C_6) 环烷基；并且

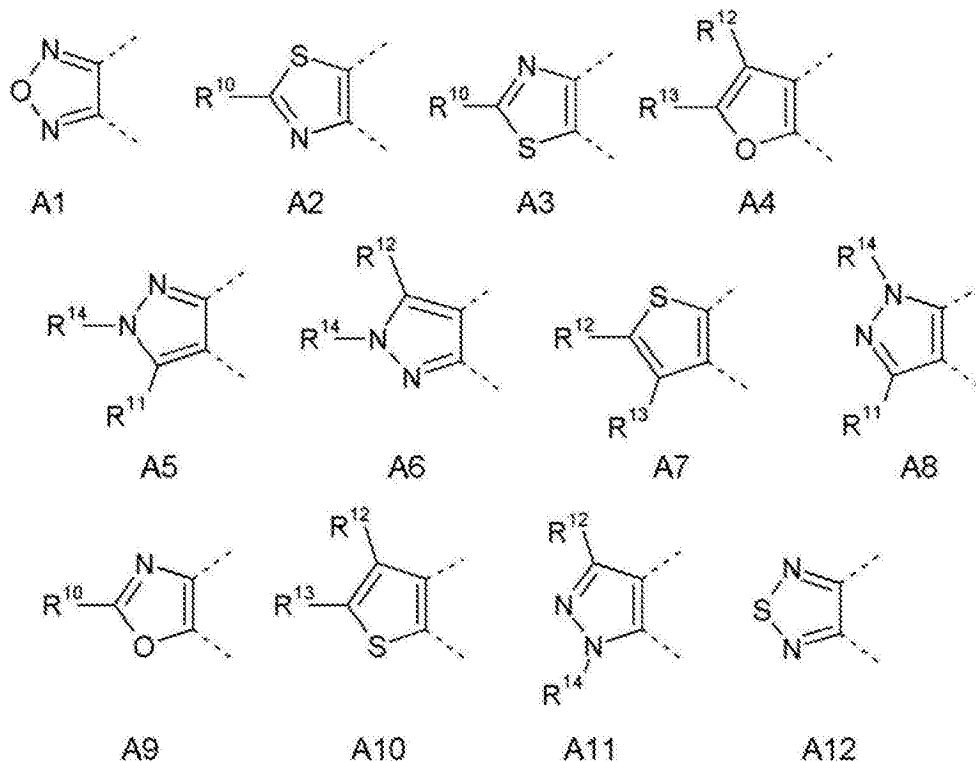
[0086] R^{14} 为氢、或被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基或二- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基，或为 (C_1-C_6) 烷基羰基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基，或

[0087] (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基羰基、 (C_3-C_6) 环烷氧基羰基、 (C_3-C_6) 环烷基磺酰基，所述基团被 n 个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基的基团取代。

[0088] 特别优选式 (I) 的酮基磺内酰胺和二酮基吡啶，其中

[0089] A 为如下所示的五元杂环 A1-A12 之一，其中虚线意为连接至相邻的吡啶或酮基磺内酰胺环的键，

[0090]



[0091] V 为 $C(=O)$ 或 $S(O)_2$ ；

[0092] n 为 0、1、2 或 3；

[0093] G 为氢；

[0094] W 为各自被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_3-C_6) 炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、二- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_6) 烷基或 (C_3-C_6) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基；

[0095] X、Y 和 Z 各自独立地为氢、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、卤素、氰基、硝基、卤

代-(C₁-C₆)烷基、卤代-(C₁-C₆)烷氧基、(C₃-C₆)环烷基、(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、卤代-(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基；

[0096] R¹⁰为氢、或被n个卤原子取代的(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)烷基亚磺酰基或(C₁-C₄)烷基磺酰基；

[0097] R¹¹、R¹²和R¹³各自独立地为氢、卤素、或被n个卤原子取代的(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷硫基-(C₁-C₄)烷基、二-(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷硫基、(C₁-C₄)烷基亚磺酰基或(C₁-C₄)烷基磺酰基，或被n个选自卤素、(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)烷氧基的基团取代的(C₃-C₆)环烷基，以及

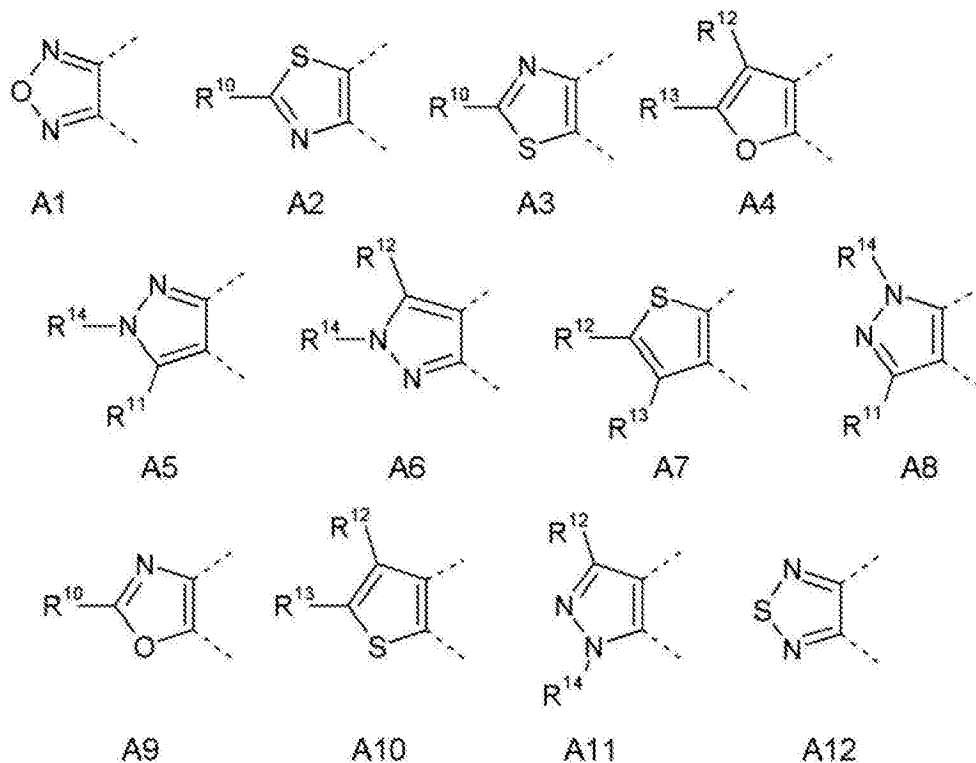
[0098] R¹⁴为氢、或被n个卤原子取代的(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷硫基-(C₁-C₄)烷基或二-(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基，或为(C₁-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)烷氧基羰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基，或

[0099] (C₃-C₆)环烷基、(C₃-C₆)环烷基羰基、(C₃-C₆)环烷氧基羰基、(C₃-C₆)环烷基磺酰基，所述基团被n个选自卤素、(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)烷氧基的基团取代。

[0100] 还特别优选式(I)的酮基磺内酰胺和二酮基吡啶，其中

[0101] A为如下所示的五元杂环A1-A12之一，其中虚线意为连接至相邻的吡啶或酮基磺内酰胺环的键，

[0102]



[0103] V为C(=O)或S(O)₂；

[0104] n为0、1、2或3；

[0105] G为C(=O)R¹；

[0106] R¹为各自被n个卤原子取代的(C₁-C₆)烷基；

[0107] W为各自被n个卤原子取代的(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₃-C₆)炔基、(C₃-C₆)环烷基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、二-(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷硫

基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷基亚磺酰基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷基磺酰基-(C₁-C₆)烷基或(C₃-C₆)环烷基-(C₁-C₆)烷基；

[0108] X、Y和Z各自独立地为氢、(C₁-C₆)烷基、(C₃-C₆)环烷基、卤素、氰基、硝基、卤代-(C₁-C₆)烷基、卤代-(C₁-C₆)烷氧基、(C₃-C₆)环烷基、(C₁-C₆)烷氧基、(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、卤代-(C₁-C₆)烷氧基-(C₁-C₆)烷基；

[0109] R¹⁰为氢、或被n个卤原子取代的(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷氧基、(C₁-C₄)烷基硫基、(C₁-C₄)烷基亚磺酰基或(C₁-C₄)烷基磺酰基；

[0110] R¹¹、R¹²和R¹³各自独立地为氢、卤素、或由n个卤原子取代的(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷基硫基-(C₁-C₄)烷基、二-(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷基硫基、(C₁-C₄)烷基亚磺酰基或(C₁-C₄)烷基磺酰基，或被n个选自卤素、(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)烷氧基的基团取代的(C₃-C₆)环烷基，以及

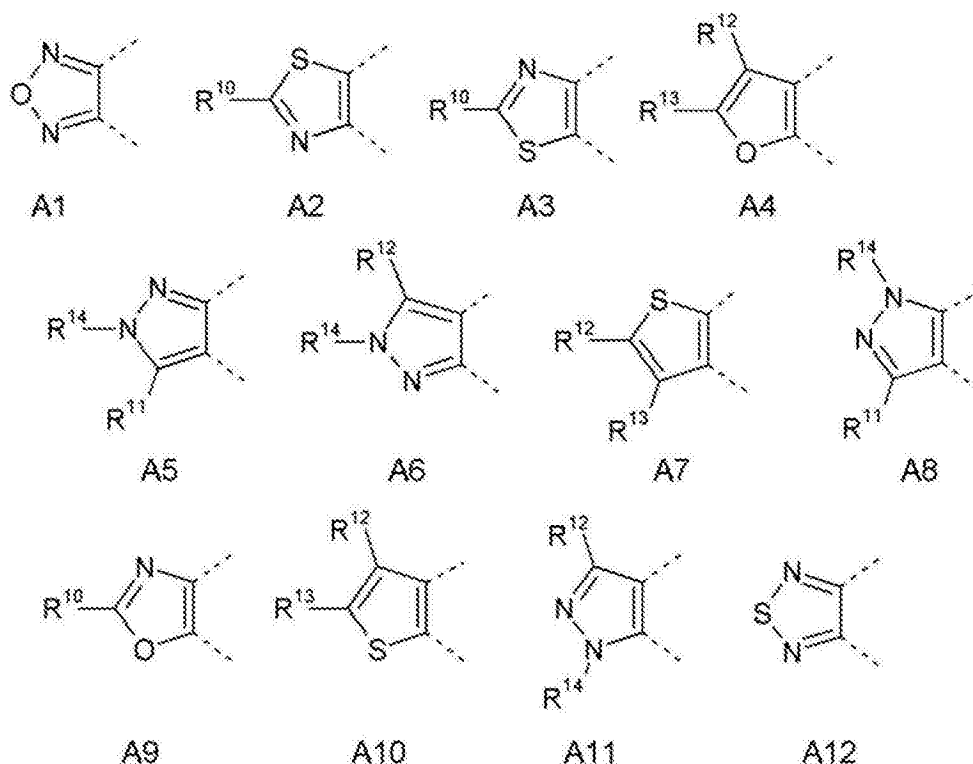
[0111] R¹⁴为氢、或被n个卤原子取代的(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)炔基、(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基、(C₁-C₄)烷基硫基-(C₁-C₄)烷基或二-(C₁-C₄)烷氧基-(C₁-C₆)烷基，或为(C₁-C₆)烷基羰基、(C₁-C₆)烷氧基羰基、(C₁-C₆)烷基磺酰基，或

[0112] (C₃-C₆)环烷基、(C₃-C₆)环烷基羰基、(C₃-C₆)环烷氧基羰基、(C₃-C₆)环烷基磺酰基，所述基团被n个选自卤素、(C₁-C₄)烷基和(C₁-C₄)烷氧基的基团取代。

[0113] 还特别优选式(I)的酮基磺内酰胺和二酮基吡啶，其中

[0114] A为如下所示的五元杂环A1-A12之一，其中虚线意为连接至相邻的吡啶或酮基磺内酰胺环的键，

[0115]



[0116] V为C(=O)或S(O)₂；

[0117] n为0、1、2或3；

[0118] G为C(=L)MR²；

[0119] L 为氧；

[0120] M 为氧或硫；

[0121] R^2 为各自被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基；

[0122] W 为各自被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_3-C_6) 炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、二- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_6) 烷基或 (C_3-C_6) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基；和

[0123] X、Y 和 Z 各自独立地为氢、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、卤素、氰基、硝基、卤代- (C_1-C_6) 烷基、卤代- (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、卤代- (C_1-C_6) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基；

[0124] R^{10} 为氢、或被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基或 (C_1-C_4) 烷基磺酰基；

[0125] R^{11} 、 R^{12} 和 R^{13} 各自独立地为氢、卤素、或被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、二- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基或 (C_1-C_4) 烷基磺酰基，或被 n 个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基的基团取代的 (C_3-C_6) 环烷基，以及

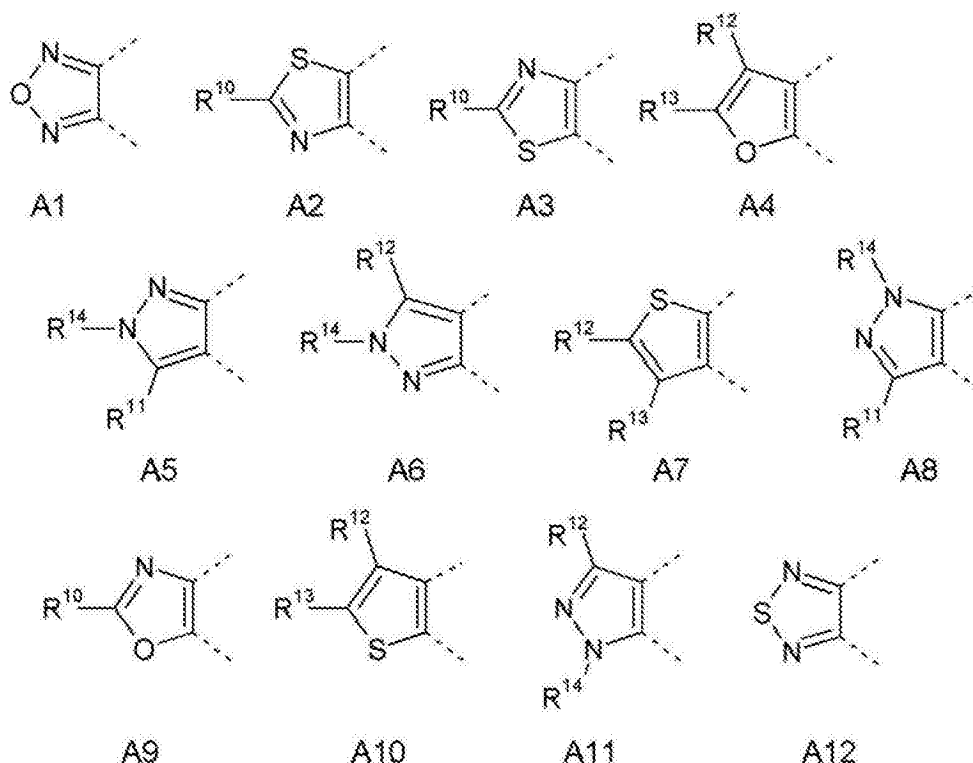
[0126] R^{14} 为氢、或被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基或二- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基，或为 (C_1-C_6) 烷基羰基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基，或

[0127] (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基羰基、 (C_3-C_6) 环烷氧基羰基、 (C_3-C_6) 环烷基磺酰基，所述基团被 n 个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基的基团取代。

[0128] 还特别优选式 (I) 的酮基磺内酰胺和二酮基吡啶，其中

[0129] A 为如下所示 A1-A2 的五元杂环之一，其中虚线意为连接至相邻的吡啶或酮基磺内酰胺环的键，

[0130]



[0131] V 为 $C(=O)$ 或 $S(O)_2$;

[0132] n 为 0、1、2 或 3;

[0133] G 为 R^8 ;

[0134] R^8 为被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 炔基;

[0135] W 为各自被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_3-C_6) 炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、二- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷基磺酰基- (C_1-C_6) 烷基或 (C_3-C_6) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基;

[0136] X、Y 和 Z 各自独立地为氢、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基、卤素、氰基、硝基、卤代- (C_1-C_6) 烷基、卤代- (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、卤代- (C_1-C_6) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基;

[0137] R^{10} 为氢、或被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基或 (C_1-C_4) 烷基磺酰基;

[0138] R^{11} 、 R^{12} 和 R^{13} 各自独立地为氢、卤素、或被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基、二- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基、 (C_1-C_4) 烷基亚磺酰基或 (C_1-C_4) 烷基磺酰基,或被 n 个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基的基团取代的 (C_3-C_6) 环烷基,以及

[0139] R^{14} 为氢、或被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_4) 烷硫基- (C_1-C_4) 烷基或二- (C_1-C_4) 烷氧基- (C_1-C_6) 烷基,或为 (C_1-C_6) 烷基羰基、 (C_1-C_6) 烷氧基羰基、 (C_1-C_6) 烷基磺酰基,或

[0140] (C_3-C_6) 环烷基、 (C_3-C_6) 环烷基羰基、 (C_3-C_6) 环烷氧基羰基、 (C_3-C_6) 环烷基磺酰基,所述基团被 n 个选自卤素、 (C_1-C_4) 烷基和 (C_1-C_4) 烷氧基的基团取代。

[0141] 非常特别优选为在表 1 至表 124 中具体指出的式 (I) 的化合物。

[0142] 所用缩写是指：

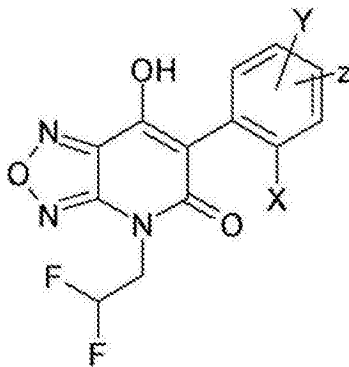
[0143] Bz = 苄基 c-Pr = 环丙基 Et = 乙基

[0144] i-Bu = 异丁基 t-Bu = 叔丁基 i-Pr = 异丙基

[0145] Me = 甲基 Ph = 苯基 c = 环

[0146] 表 1 : 本发明的式 (I) 的化合物, 其中 G 为氢, V 为 C = O, W 为二氟乙基, 以及 A 为 A1 :

[0147]



[0148]

编号	X	Y	Z
1	F	H	H
2	Cl	H	H
3	Br	H	H
4	I	H	H
5	OMe	H	H
6	EtO	H	H
7	CF ₃	H	H
8	CN	H	H
9	NO ₂	H	H
10	OCF ₃	H	H
11	H	3-CF ₃	H
12	H	3-Me	H
13	H	3-F	H

14	H	3-Cl	H
15	H	3-CN	H
16	H	3-Br	H
17	H	3-I	H
18	H	3-NO ₂	H
19	H	3-OCF ₃	H
20	H	3-OMe	H
21	H	3-EtO	H
22	H	4-CF ₃	H

[0149]

编号	X	Y	Z
23	H	4-Me	H
24	H	4-F	H
25	H	4-Cl	H
26	H	4-CN	H
27	H	4-Br	H
28	H	4-I	H
29	H	4-NO ₂	H
30	H	4-OCF ₃	H
31	H	4-OMe	H
32	H	4-EtO	H
33	Cl	4-Cl	H
34	H	3-Cl	4-Cl
35	Br	4-Cl	H

36	Cl	H	6-Cl
37	Cl	H	6-F
38	F	H	6-F
39	Me	4-Cl	H
40	Me	4-Br	H
41	Me	4-I	H
42	Cl	4-Cl	6-Cl
43	Cl	6-Me	4-Br
44	Cl	6-Me	4-Cl
45	Br	6-Me	4-Cl
46	Br	6-Me	4-Br
47	OMe	6-Me	4-Cl
48	EtO	6-Me	4-Cl
49	Cl	6-Me	4-Br
50	Cl	6-Et	4-Cl
51	Br	6-Et	4-Cl
52	Br	6-Et	4-Br
53	OMe	6-Et	4-Cl
54	EtO	6-Et	4-Cl
55	Br	4-Me	6-Br
56	Cl	4-Me	6-Cl
57	OMe	4-Me	6-Me
58	EtO	4-Me	6-Me

[0150]

编号	X	Y	Z
59	OMe	6-Et	4-Me
60	EtO	6-Et	4-Me
61	Cl	4-Me	6-Et
62	Et	6-Et	4-Cl
63	Et	6-Me	4-Br
64	Et	6-Et	4-Br
65	Et	6-Me	4-Cl
66	Et	6-Me	4-Br
67	OMe	4-Me	6-Cl
68	EtO	4-Me	6-Cl
69	I	H	4-Me
70	I	6-Me	H
71	I	6-Et	H
72	I	4-Me	6-Me
73	I	6-Et	4-Me
74	I	6-Me	4-Cl
75	I	6-Et	6-Cl
76	I	6-Cl	4-Me
77	Me	4-I	H
78	Et	4-I	H
79	Et	4-I	6-Me
80	Et	4-I	6-Et
81	Cl	6-Me	4-I

82	Cl	6-Et	4-I
83	c-Pr	H	H
84	c-Pr	4-Me	H
85	c-Pr	H	6-Me
86	c-Pr	6-Et	H
87	c-Pr	4-Me	6-Me
88	c-Pr	6-Et	4-Me
89	c-Pr	4-Me	6-Cl
90	c-Pr	6-Et	4-Cl
91	c-Pr	4-Cl	6-Me
92	Me	4-c-Pr	H
93	Et	4-c-Pr	H
94	Me	4-c-Pr	6-Me

[0151]

编号	X	Y	Z
95	Et	4-c-Pr	6-Me
96	Et	4-c-Pr	6-Et
97	Cl	6-Me	4-c-Pr
98	Cl	6-Et	4-c-Pr
99	Et	6-Et	4-I
100	Cl	6-F	3-Me
101	F	6-F	3-F
102	EtO	6-F	3-F
103	F	6-F	3-EtO

104	F	H	5-Cl
105	H	3-CF ₃	5-CF ₃
106	Me	4-OCF ₃	H
107	OCF ₃	4-Me	H
108	OCF ₃	5-Me	H
109	OCF ₃	6-Me	H
110	OCF ₃	6-Et	H
111	Me	5-OCF ₃	H
112	Me	3-OCF ₃	6-Me
113	Br	4-OCF ₃	6-Cl
114	Br	4-OCF ₃	6-Br
115	OMe	4-OCF ₃	6-Br
116	OMe	4-OCF ₃	6-Cl
117	Cl	4-OCF ₃	6-Cl
118	OMe	4-OCF ₃	6-Cl
119	OMe	4-OCF ₃	6-Br
120	Me	4-OCF ₃	6-Me
121	Cl	4-OCF ₃	6-Me
122	OCF ₃	6-Cl	4-Br
123	OCF ₃	6-Me	4-Me
124	OCF ₃	6-OMe	4-Cl
125	OCF ₃	6-Cl	4-Me
126	Cl	5-OCF ₃	H
127	Br	5-OCF ₃	H

128	OCF ₃	6-Et	4-Cl
129	Br	4-Cl	6-Br
130	Br	4-Cl	6-Cl

[0152]

编号	X	Y	Z
131	Br	4-Me	6-Cl
132	Cl	3-Me	6-Cl
133	Cl	3-F	6-F
134	F	3-Me	6-F
135	F	4-OMe	6-F
136	F	3-OMe	6-F
137	Cl	3-Cl	6-F
138	Cl	4-Et	6-Cl
139	Cl	4-Et	6-Br
140	Cl	3-Br	6-Cl
141	Cl	4-CF ₃	6-F
142	Cl	4-CF ₃	6-Cl
143	Cl	3-Cl	6-Cl
144	Cl	3-CF ₃	6-Cl
145	F	3-F	6-NO ₂
146	F	4-NO ₂	6-F
147	Cl	4-CF ₃	6-NO ₂
148	Br	6-NO ₂	H
149	F	4-CF ₃	6-F

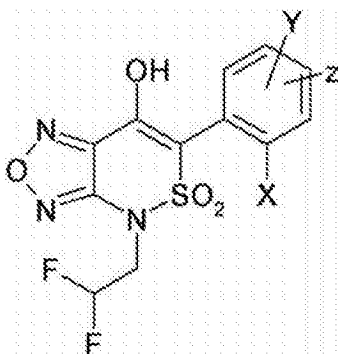
150	Br	6-Br	H
151	Cl	3-OMe	6-F
152	F	3-OMe	6-Cl
153	F	4-Cl	6-F
154	F	4-Br	6-F
155	F	4-Br	6-Br
156	Cl	4-Br	6-Cl
157	F	4-EtO	6-F
158	F	3-Cl	6-F
159	Cl	3-Cl	6-Br
160	F	3-F	6-Cl
161	F	3-F	6-Br
162	F	3-F	6-I
163	Cl	6-CF ₃	H
164	Cl	3-Cl	6-CF ₃
165	F	3-Cl	6-CF ₃
166	Cl	3-CF ₃	6-Cl

[0153]

编号	X	Y	Z
167	c-Pr	4-Cl	6-Cl
168	Me	4-CF ₂ -CF ₃	6-Me
169	Cl	3-c-Pr	6-Cl
170	Cl	3-I	6-Cl
171	Me	4-c-Pr-(2'-c-Pr)	6-Me

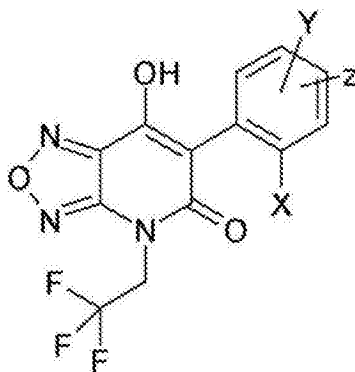
[0154] 表 2:本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为二氟乙基, A 为 A1, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0155]



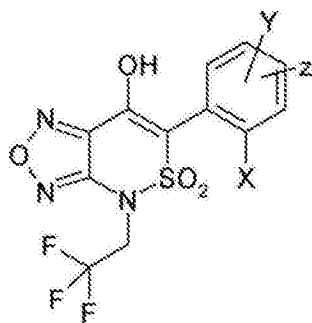
[0156] 表 3:本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为三氟乙基, A 为 A1, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0157]



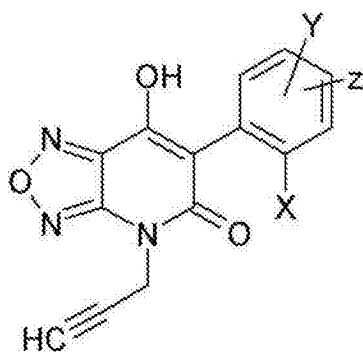
[0158] 表 4:本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为三氟乙基, A 为 A1, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0159]



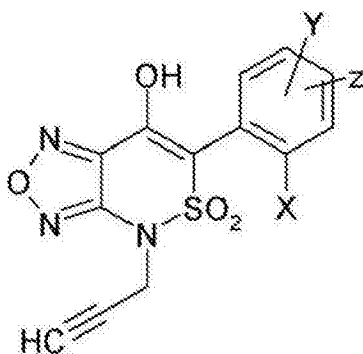
[0160] 表 5:本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为丙炔基, A 为 A1, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0161]



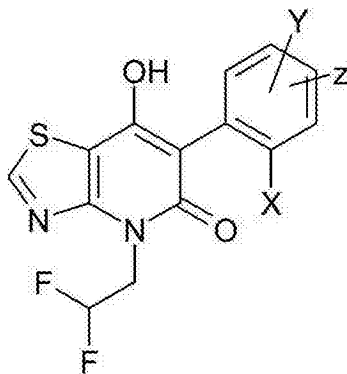
[0162] 表 6 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为丙炔基, A 为 A1, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义 :

[0163]



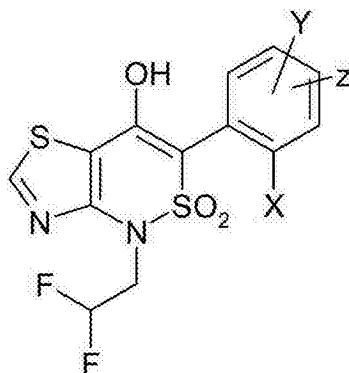
[0164] 表 7 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为二氟乙基, A 为 A2, R^{10} 为氢, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义 :

[0165]



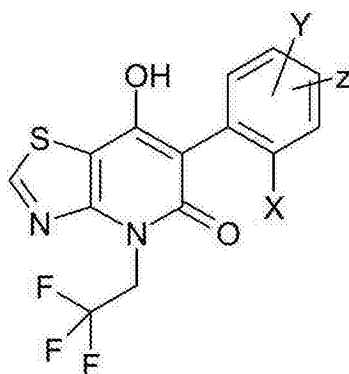
[0166] 表 8 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为二氟乙基, A 为 A2, R^{10} 为氢, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义 :

[0167]



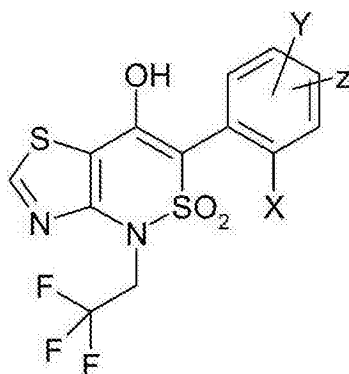
[0168] 表 9 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为三氟乙基, A 为 A2, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0169]



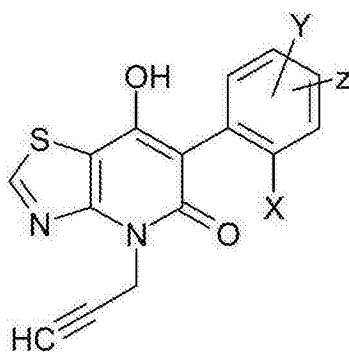
[0170] 表 10 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为三氟乙基, A 为 A2, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0171]



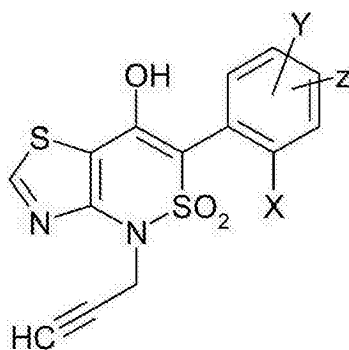
[0172] 表 11 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为丙炔基, A 为 A2, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0173]



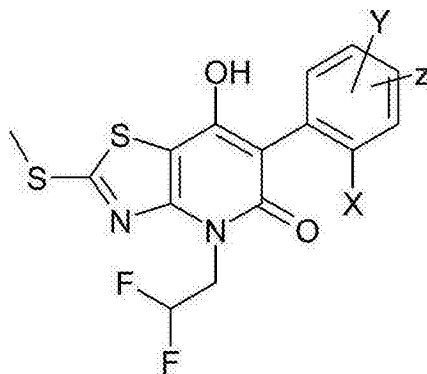
[0174] 表 12 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为丙炔基, R^{10} 为氢,A 为 A_2 ,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0175]



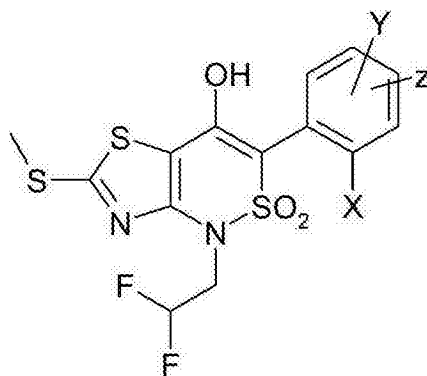
[0176] 表 13 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为二氟乙基,A 为 A_2 , R^{10} 为甲硫基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0177]



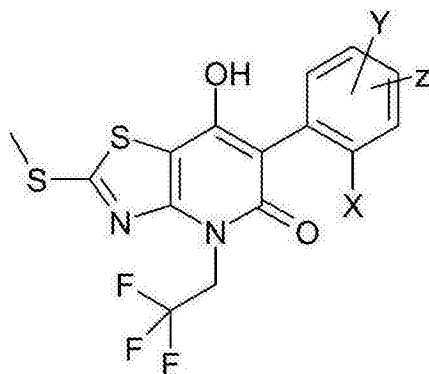
[0178] 表 14 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为二氟乙基,A 为 A_2 , R^{10} 为甲硫基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0179]



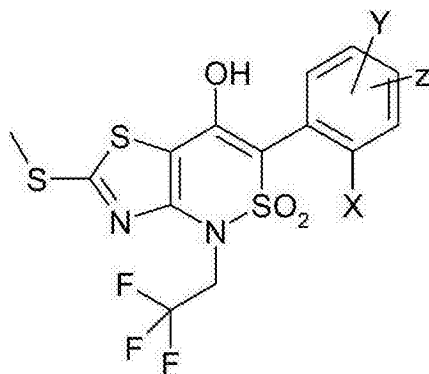
[0180] 表 15 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为三氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为甲硫基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0181]



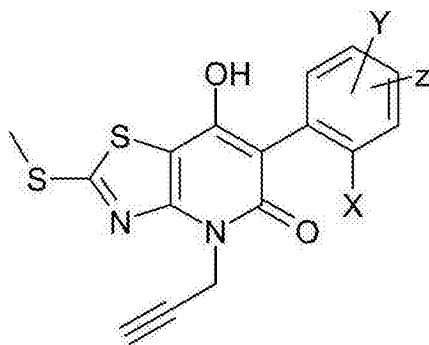
[0182] 表 16 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为三氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为甲硫基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0183]



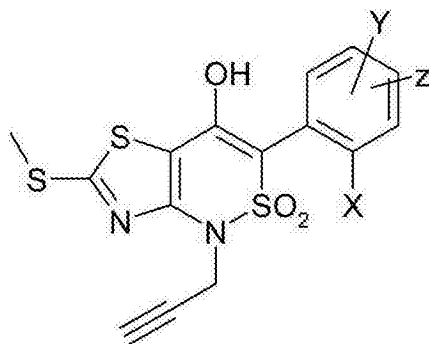
[0184] 表 17 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为丙炔基,A 为 A2, R^{10} 为甲硫基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0185]



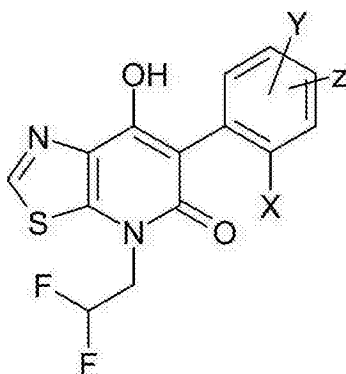
[0186] 表 18 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为丙炔基,A 为 A2, R^{10} 为甲硫基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0187]



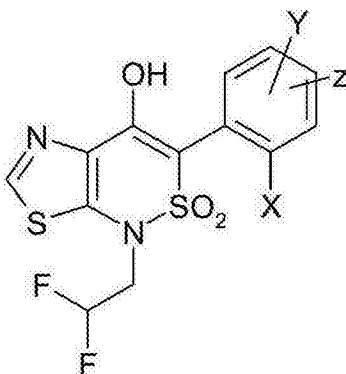
[0188] 表 19 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为二氟乙基,A 为 A3, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0189]



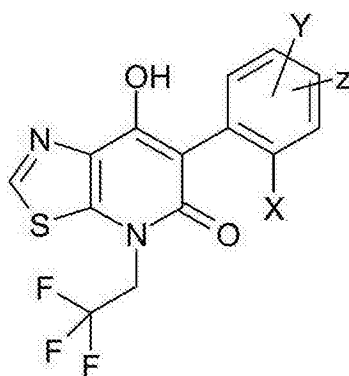
[0190] 表 20 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为二氟乙基,A 为 A3, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0191]



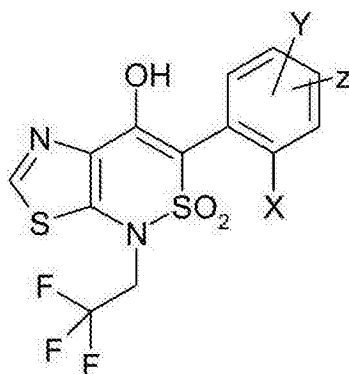
[0192] 表 21 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为三氟乙基,A 为 A3, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0193]



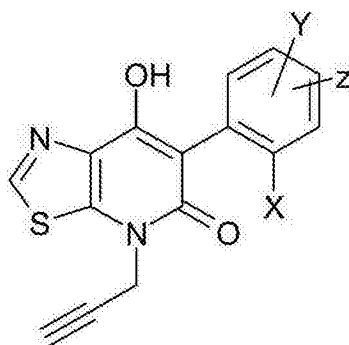
[0194] 表 22 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为三氟乙基,A 为 A3, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0195]



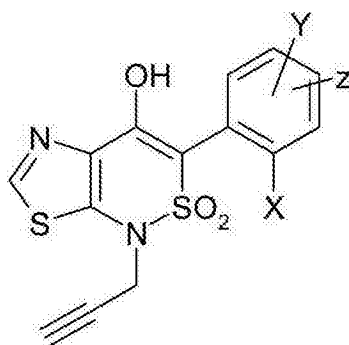
[0196] 表 23 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为丙炔基,A 为 A3, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0197]



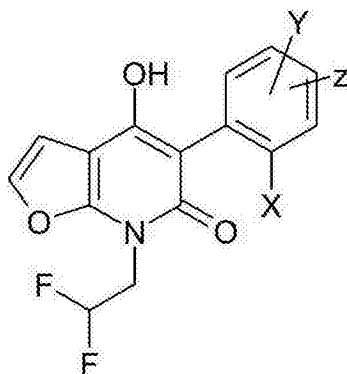
[0198] 表 24 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为丙炔基,A 为 A3, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自如表 1 所定义:

[0199]



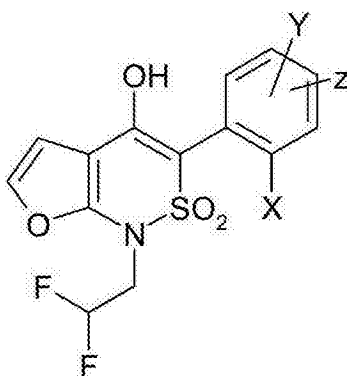
[0200] 表 25 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为二氟乙基,A 为 A4, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0201]



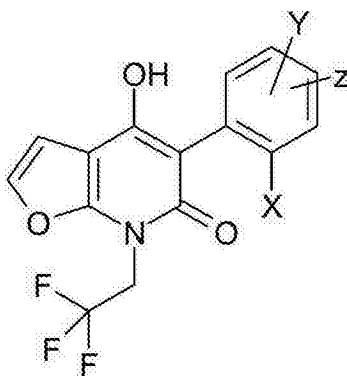
[0202] 表 26 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为二氟乙基,A 为 A4, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0203]



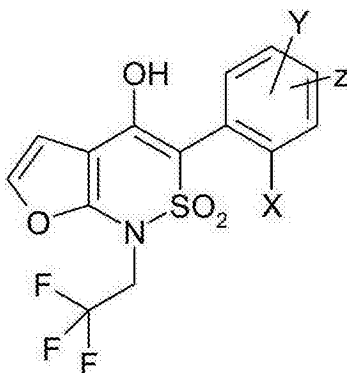
[0204] 表 27 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为三氟乙基,A 为 A4, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0205]



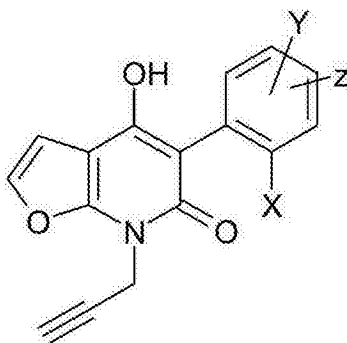
[0206] 表 28 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为三氟乙基,A 为 A4, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0207]



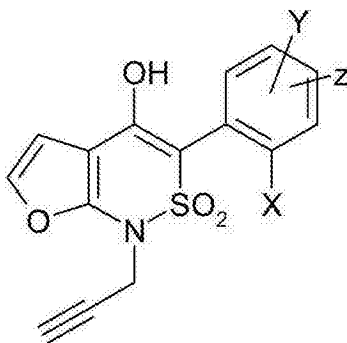
[0208] 表 29 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为丙炔基,A 为 A4, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0209]



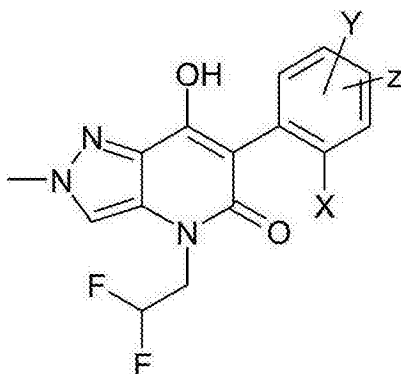
[0210] 表 30 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为丙炔基,A 为 A4, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0211]



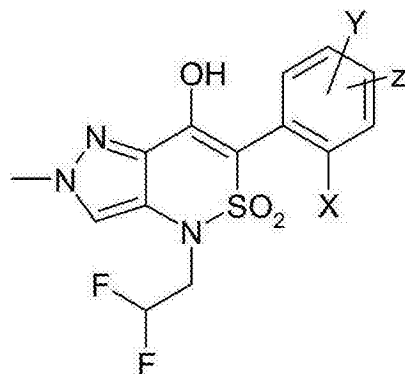
[0212] 表 31 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为二氟乙基,A 为 A5, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0213]



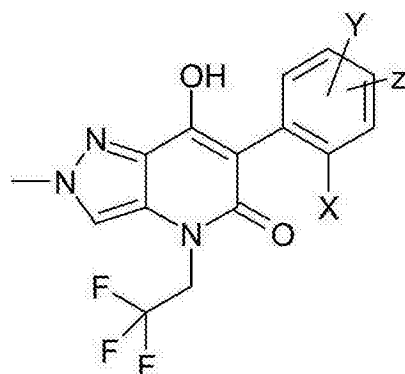
[0214] 表 32 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为二氟乙基,A 为 A5, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0215]



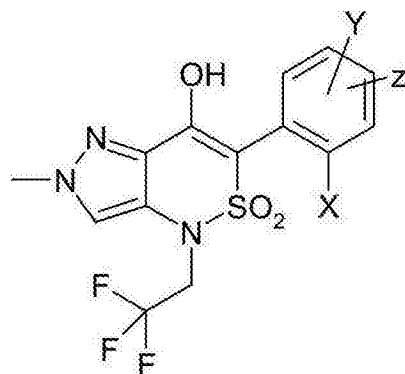
[0216] 表 33 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为三氟乙基,A 为 A5, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0217]



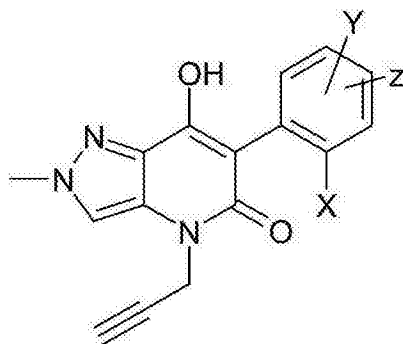
[0218] 表 34 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为三氟乙基,A 为 A5, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0219]



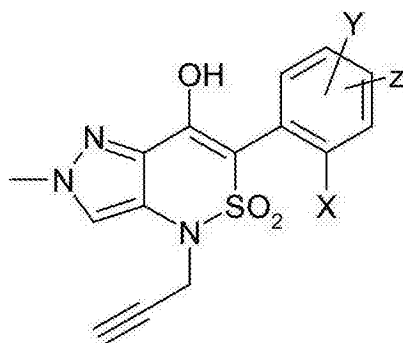
[0220] 表 35 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为丙炔基,A 为 A5, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0221]



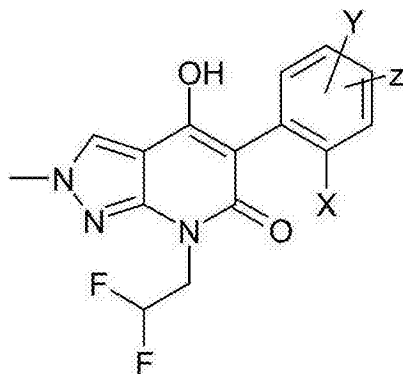
[0222] 表 36 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为丙炔基,A 为 A5, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0223]



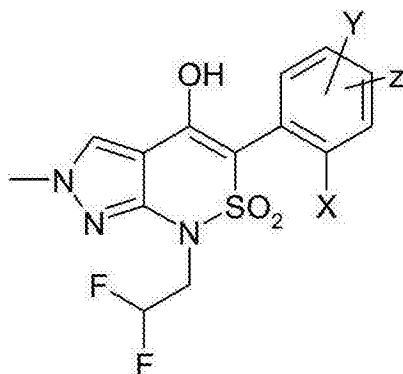
[0224] 表 37 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为二氟乙基,A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0225]



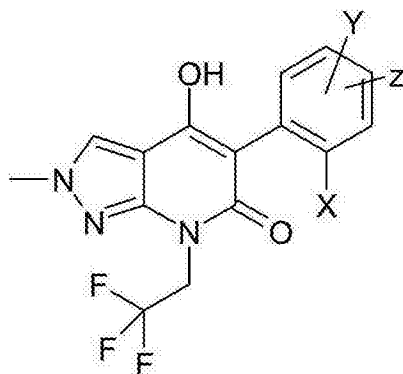
[0226] 表 38 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为二氟乙基,A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0227]



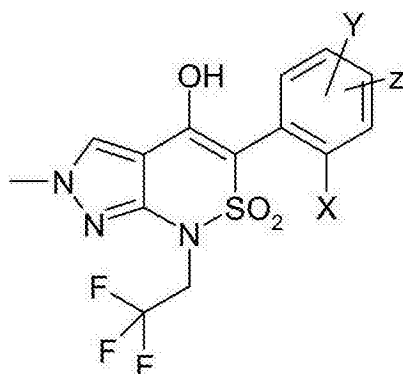
[0228] 表 39 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为三氟乙基,A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0229]



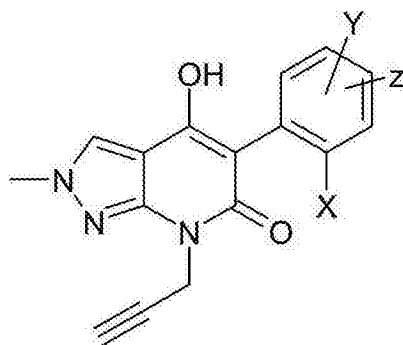
[0230] 表 40 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为三氟乙基,A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0231]



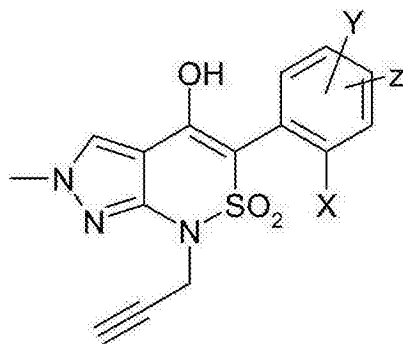
[0232] 表 41 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为丙炔基,A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0233]



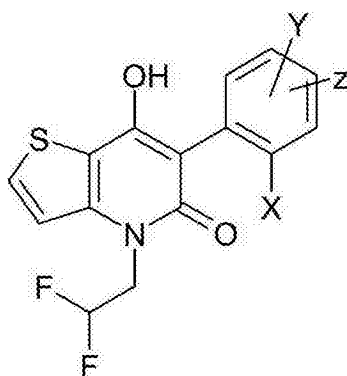
[0234] 表 42 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为丙炔基,A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0235]



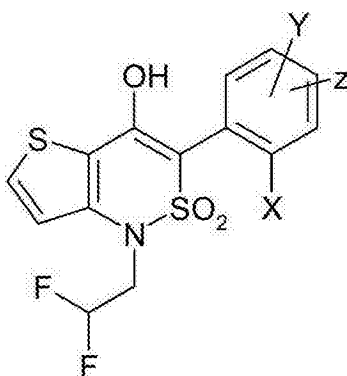
[0236] 表 43 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为二氟乙基,A 为 A7, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0237]



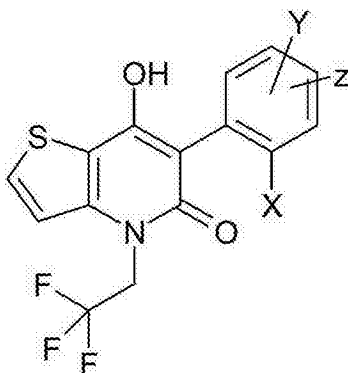
[0238] 表 44 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为二氟乙基,A 为 A7, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0239]



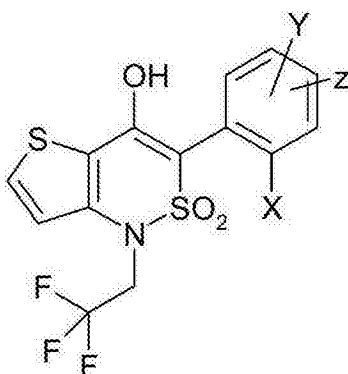
[0240] 表 45 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为三氟乙基,A 为 A7, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0241]



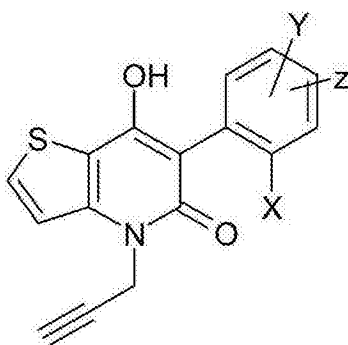
[0242] 表 46 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为三氟乙基,A 为 A7, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0243]



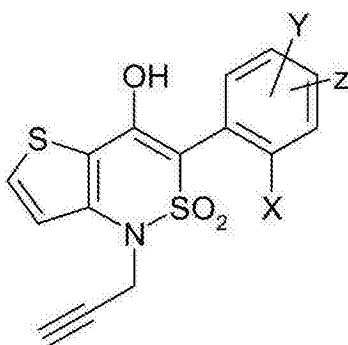
[0244] 表 47 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为丙炔基,A 为 A7, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0245]



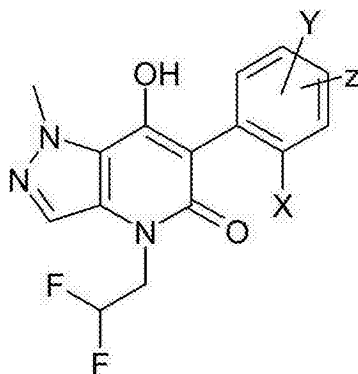
[0246] 表 48 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为丙炔基,A 为 A7, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0247]



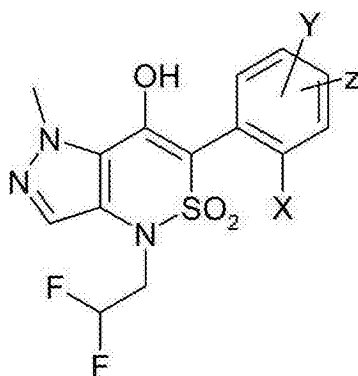
[0248] 表 49 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为二氟乙基,A 为 A8, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0249]



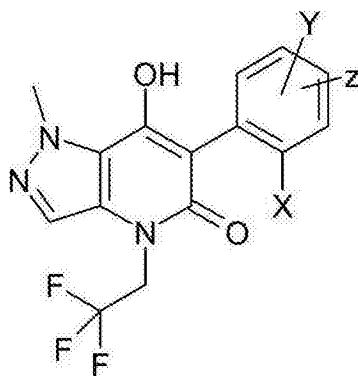
[0250] 表 50 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为二氟乙基,A 为 A8, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0251]



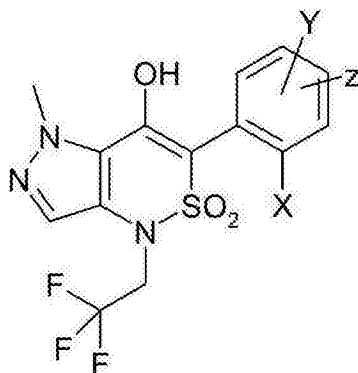
[0252] 表 51 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为三氟乙基,A 为 A8, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0253]



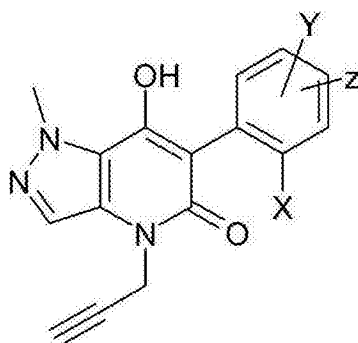
[0254] 表 52 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为三氟乙基,A 为 A8, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0255]



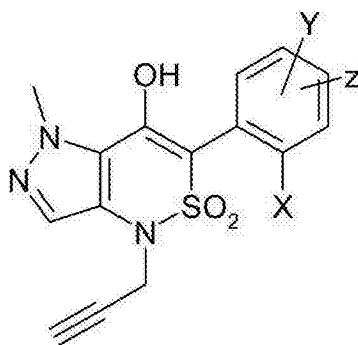
[0256] 表 53 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为丙炔基,A 为 A8, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0257]



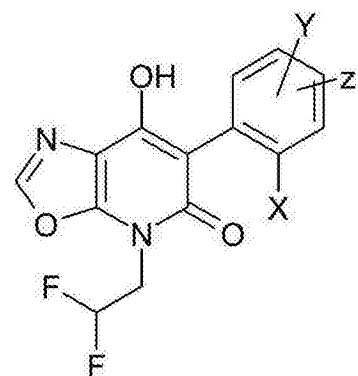
[0258] 表 54 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为丙炔基,A 为 A8, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0259]



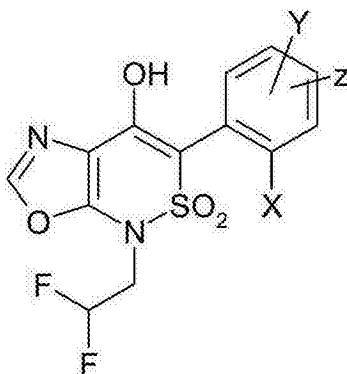
[0260] 表 55 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为二氟乙基,A 为 A9, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0261]



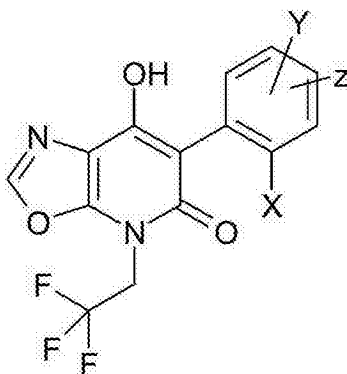
[0262] 表 56 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为二氟乙基,A 为 A9, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0263]



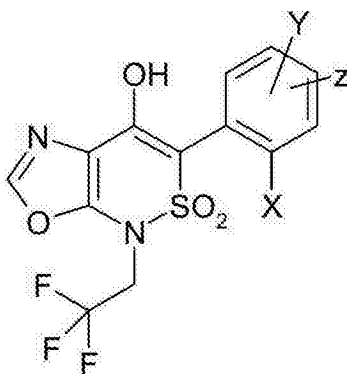
[0264] 表 57 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为三氟乙基,A 为 A9, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0265]



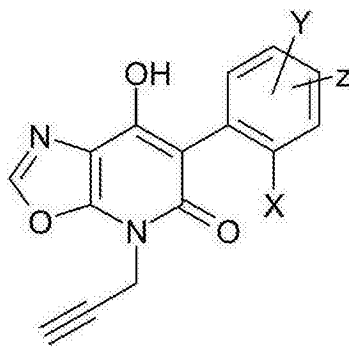
[0266] 表 58 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为三氟乙基,A 为 A9, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0267]



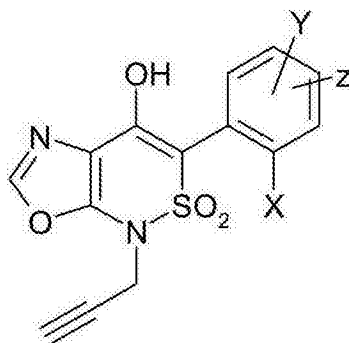
[0268] 表 59 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为丙炔基,A 为 A9, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0269]



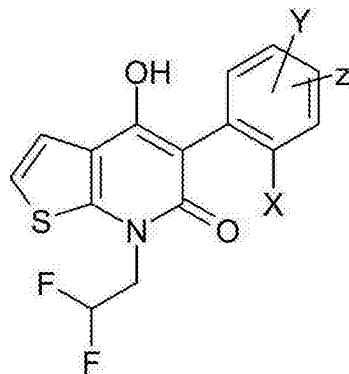
[0270] 表 60 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为丙炔基,A 为 A9, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0271]



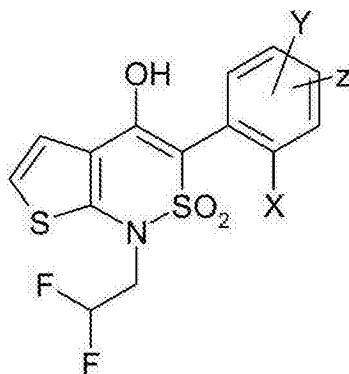
[0272] 表 61 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为二氟乙基,A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0273]



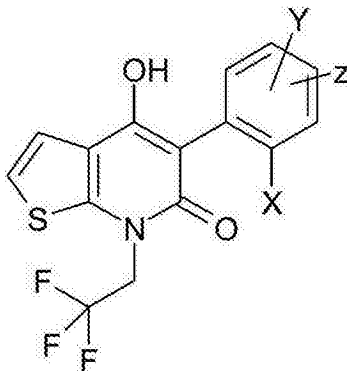
[0274] 表 62 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为二氟乙基,A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0275]



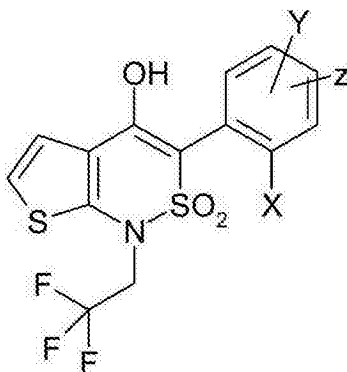
[0276] 表 63 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为三氟乙基,A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0277]



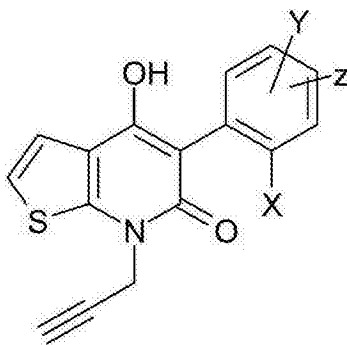
[0278] 表 64 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为三氟乙基,A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0279]



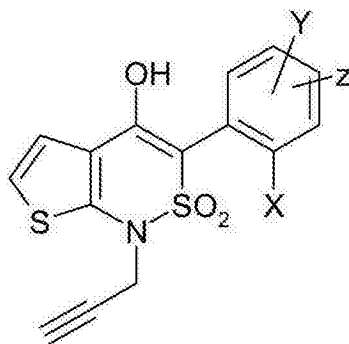
[0280] 表 65 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为丙炔基,A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0281]



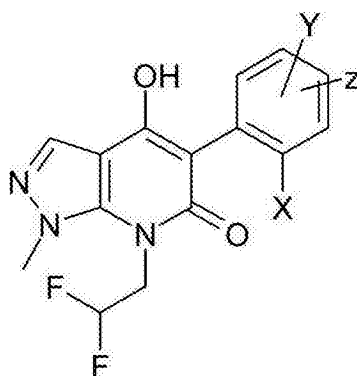
[0282] 表 66 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为丙炔基,A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0283]



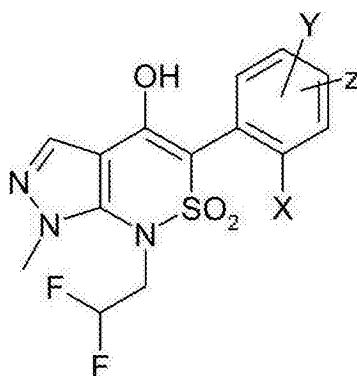
[0284] 表 67 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为二氟乙基,A 为 A11, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0285]



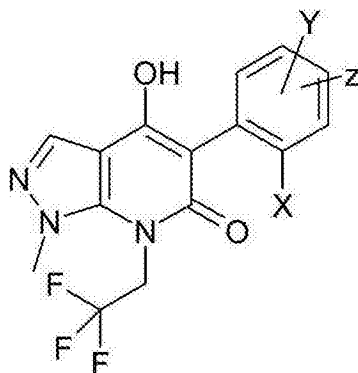
[0286] 表 68 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为二氟乙基,A 为 A11, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0287]



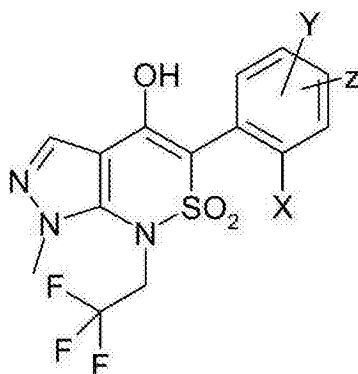
[0288] 表 69 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为三氟乙基,A 为 A11, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0289]



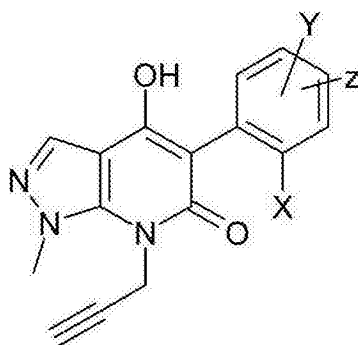
[0290] 表 70 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为三氟乙基, A 为 A11, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0291]



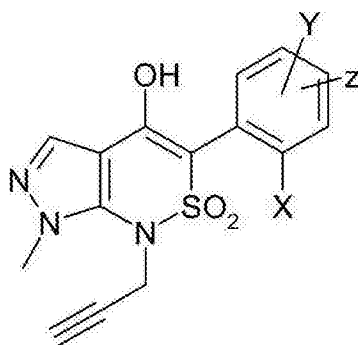
[0292] 表 71 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为丙炔基, A 为 A11, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0293]



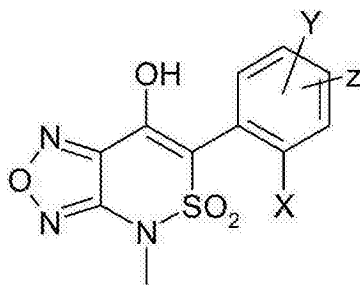
[0294] 表 72 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为丙炔基, A 为 A11, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0295]



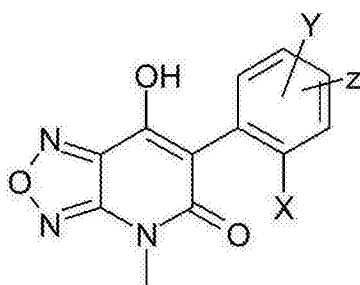
[0296] 表 73 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为甲基,A 为 A1,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0297]



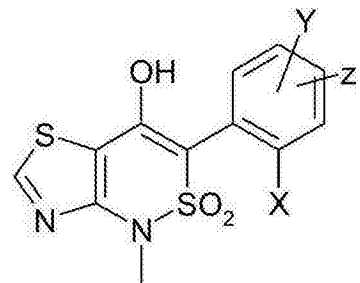
[0298] 表 74 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为甲基,A 为 A1,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0299]



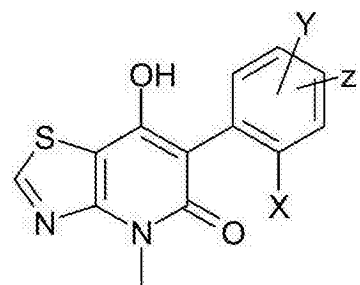
[0300] 表 75 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为甲基,A 为 A2, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0301]



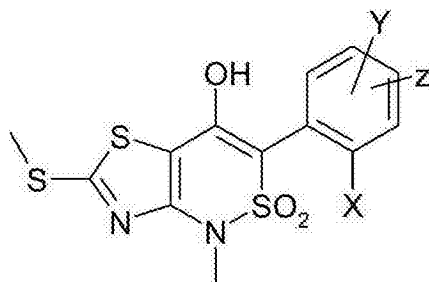
[0302] 表 76 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为甲基,A 为 A2, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0303]



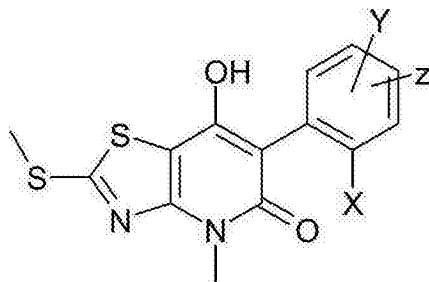
[0304] 表 77 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为甲基,A 为 A2, R^{10} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0305]



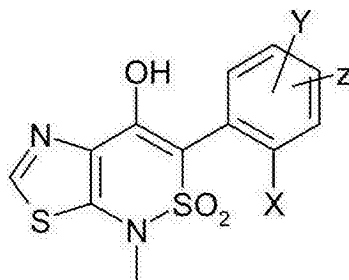
[0306] 表 78 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为甲基, A 为 A2, R^{10} 为甲硫基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0307]



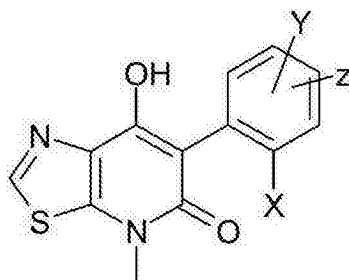
[0308] 表 79 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A3, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0309]



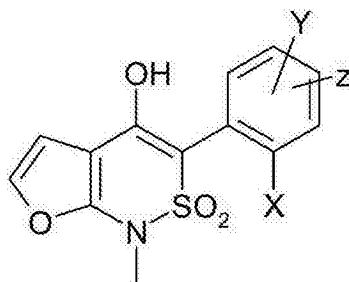
[0310] 表 80 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为甲基, A 为 A3, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0311]



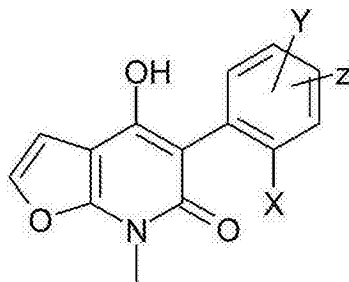
[0312] 表 81 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A4, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0313]



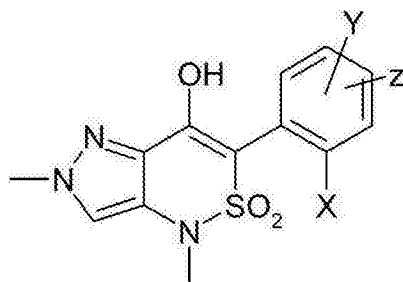
[0314] 表 82 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为甲基, A 为 A4, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0315]



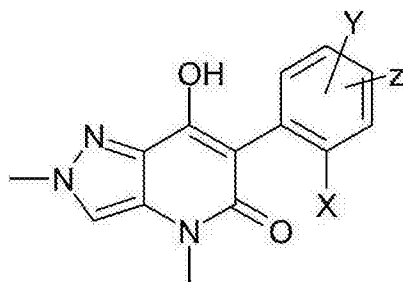
[0316] 表 83 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A5, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0317]



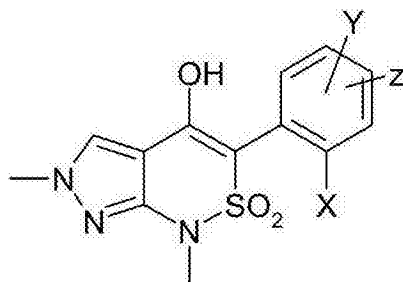
[0318] 表 84 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为甲基, A 为 A5, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0319]



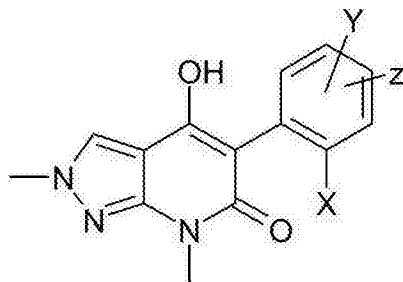
[0320] 表 85 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0321]



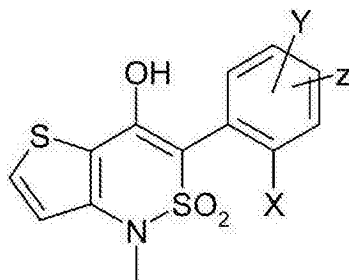
[0322] 表 86 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为甲基, A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0323]



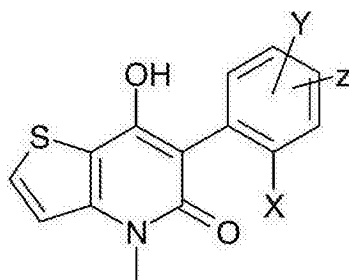
[0324] 表 87 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A7, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0325]



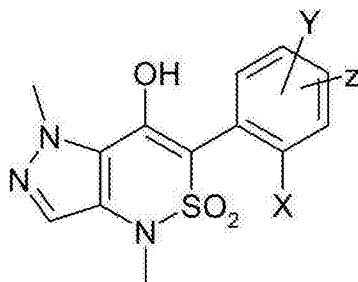
[0326] 表 88 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为甲基, A 为 A7, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0327]



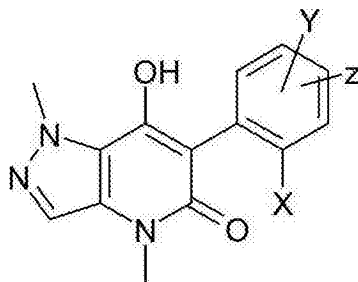
[0328] 表 89 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A8, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0329]



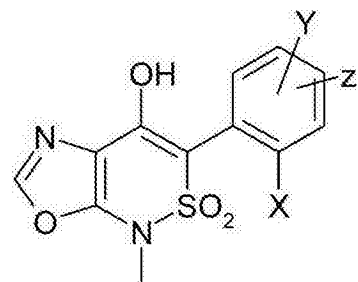
[0330] 表 90 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为甲基, A 为 A8, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0331]



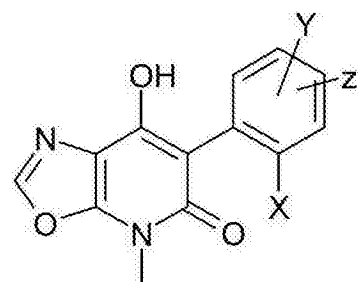
[0332] 表 91 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A9, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0333]



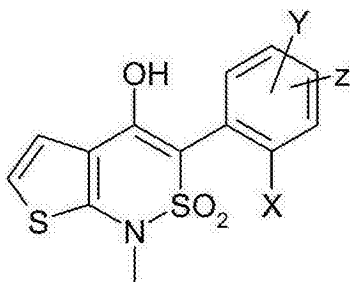
[0334] 表 92 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为甲基, A 为 A9, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0335]



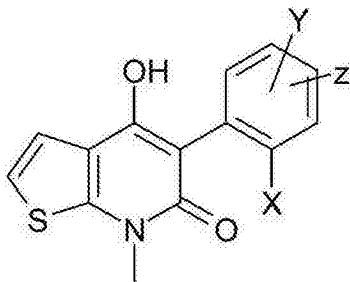
[0336] 表 93 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0337]



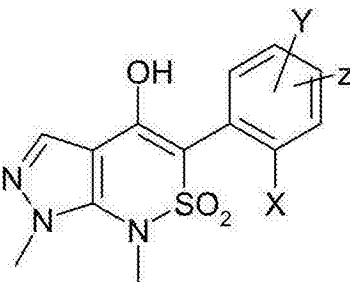
[0338] 表 94 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为甲基, A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0339]



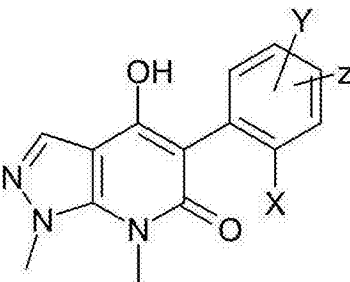
[0340] 表 95 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A11, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0341]



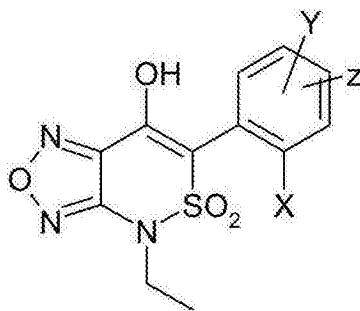
[0342] 表 96 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为甲基, A 为 A11, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0343]



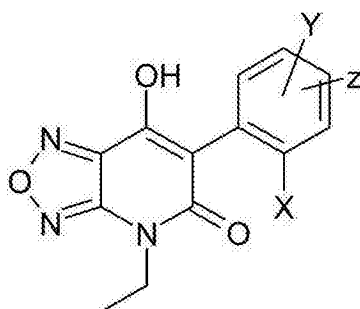
[0344] 表 97 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A1,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0345]



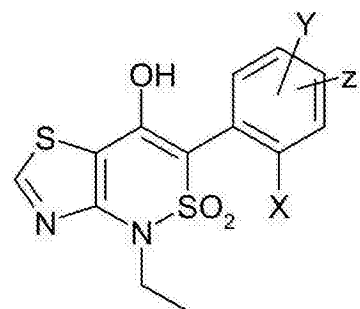
[0346] 表 98 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A1, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义 :

[0347]



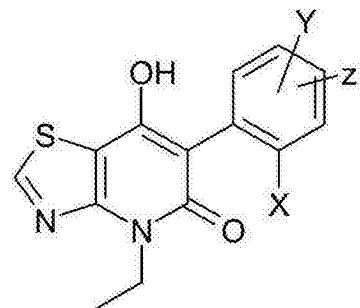
[0348] 表 99 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为氢, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义 :

[0349]



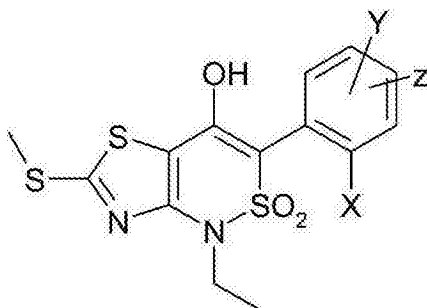
[0350] 表 100 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为氢, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义 :

[0351]



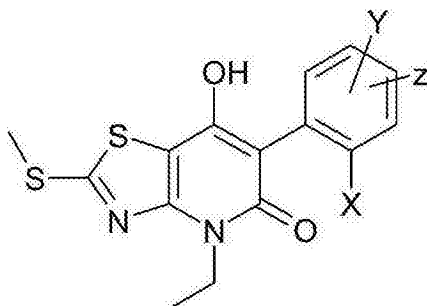
[0352] 表 101 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为甲硫基, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义 :

[0353]



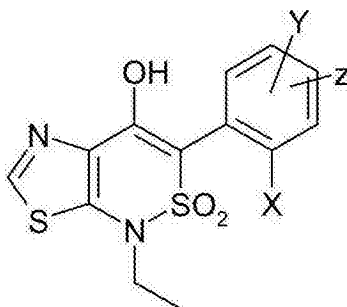
[0354] 表 102 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为甲硫基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0355]



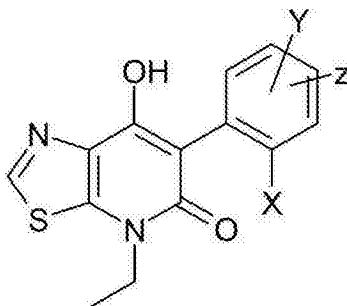
[0356] 表 103 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A3, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0357]



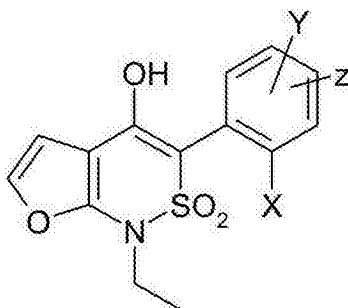
[0358] 表 104 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A3, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0359]



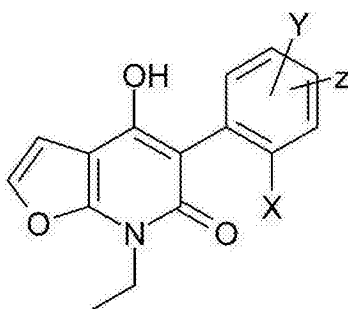
[0360] 表 105 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A4, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0361]



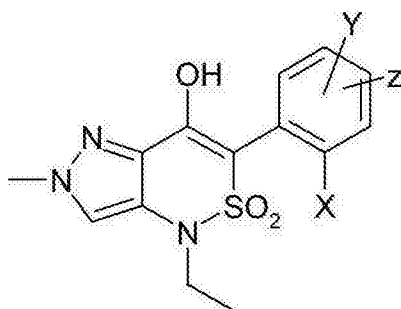
[0362] 表 106 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A4, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0363]



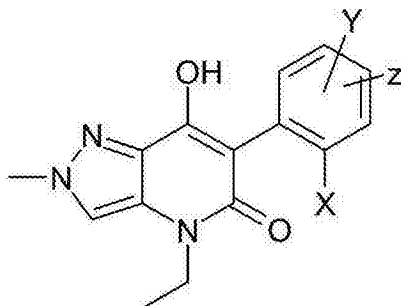
[0364] 表 107 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A5, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0365]



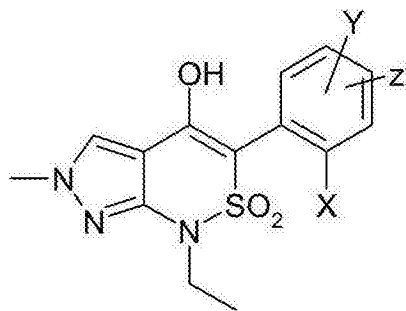
[0366] 表 108 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A5, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0367]



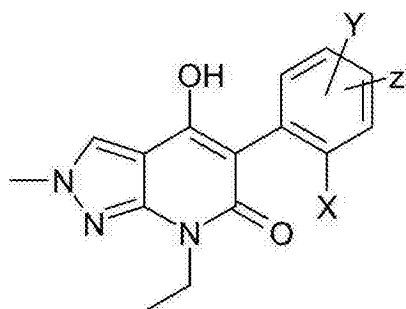
[0368] 表 109 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0369]



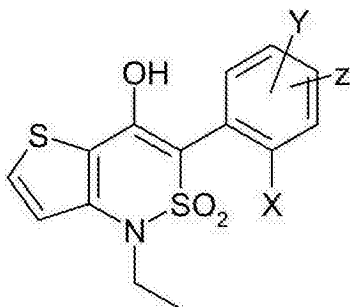
[0370] 表 110 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0371]



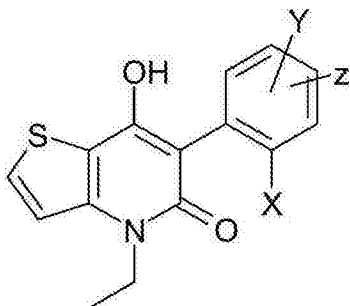
[0372] 表 111 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A7, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0373]



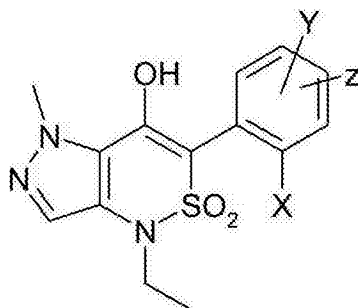
[0374] 表 112 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A7, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0375]



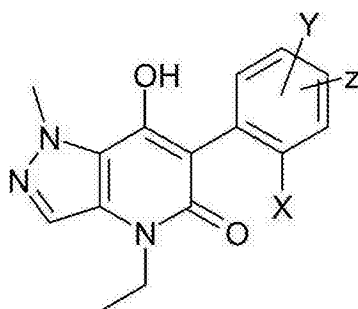
[0376] 表 113 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A8, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0377]



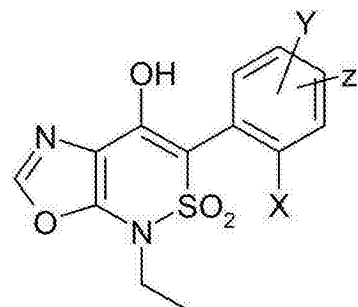
[0378] 表 114 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A8, R^{11} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0379]



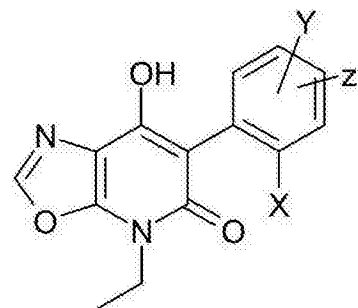
[0380] 表 115 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A9, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0381]



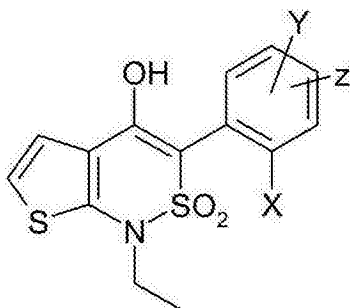
[0382] 表 116 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A9, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0383]



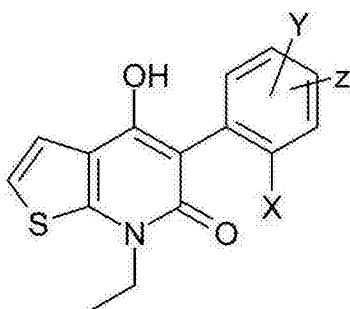
[0384] 表 117 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0385]



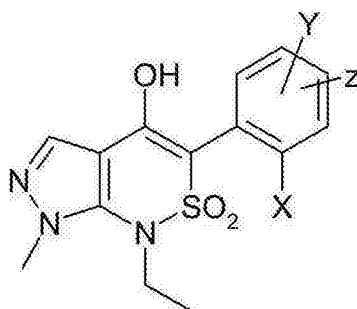
[0386] 表 118 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为乙基,A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0387]



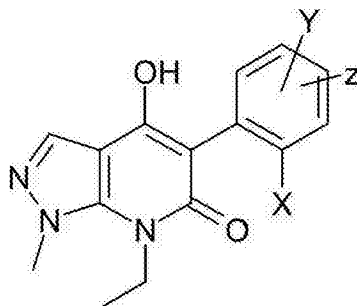
[0388] 表 119 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为乙基,A 为 A11, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0389]



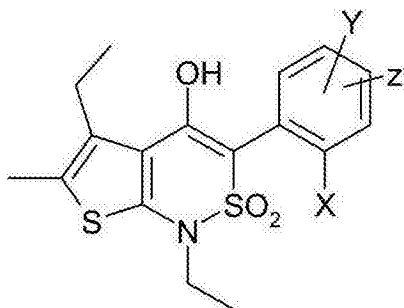
[0390] 表 120 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为乙基,A 为 A11, R^{12} 为氢, R^{14} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0391]



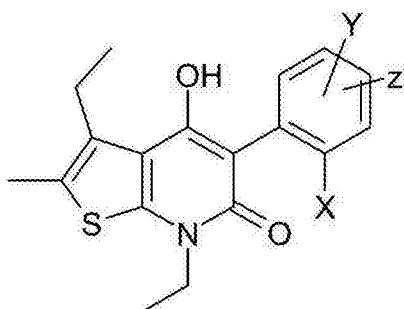
[0392] 表 121 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为乙基,A 为 A10, R^{12} 为乙基且 R^{13} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0393]



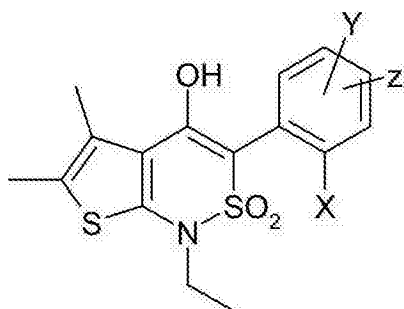
[0394] 表 122 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为乙基,A 为 A10, R^{12} 为乙基且 R^{13} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0395]



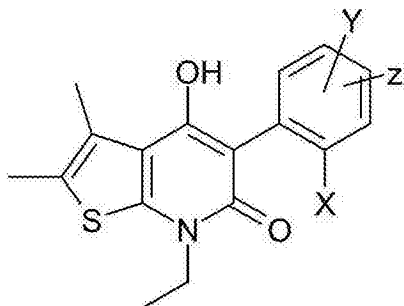
[0396] 表 123 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为乙基,A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0397]



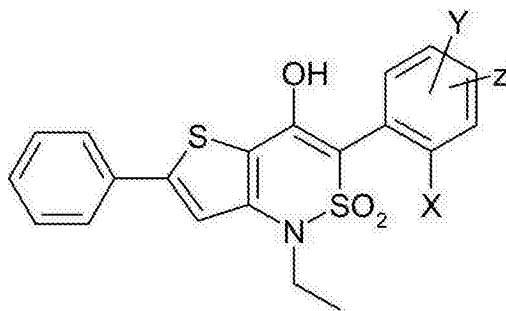
[0398] 表 124 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为乙基,A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0399]



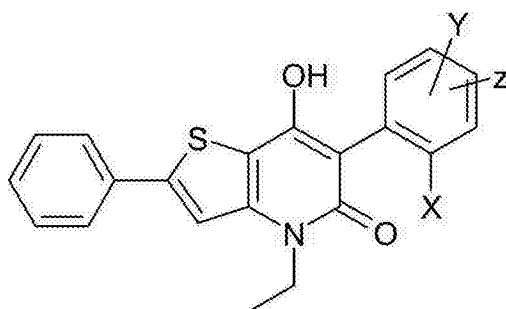
[0400] 表 125 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为乙基,A 为 A7, R^{12} 为苯基且 R^{13} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0401]



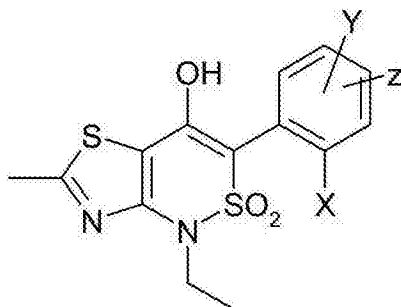
[0402] 表 126 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为乙基,A 为 A10, R^{12} 为苯基且 R^{13} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0403]



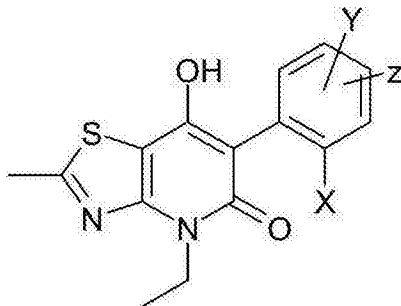
[0404] 表 127 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为乙基,A 为 A2, R^{10} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0405]



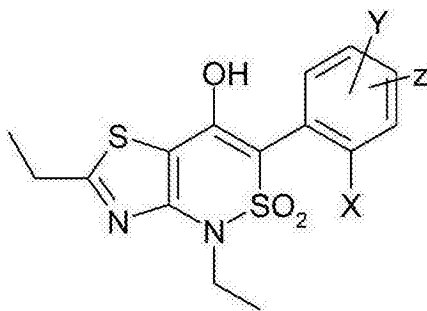
[0406] 表 128 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为乙基,A 为 A2, R^{10} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0407]



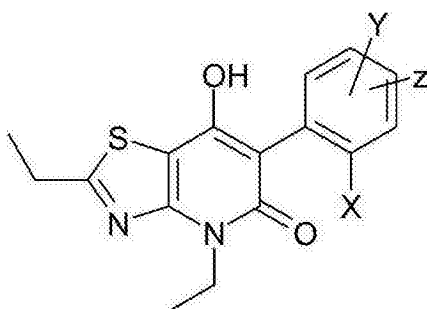
[0408] 表 129 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为乙基,A 为 A2, R^{10} 为乙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0409]



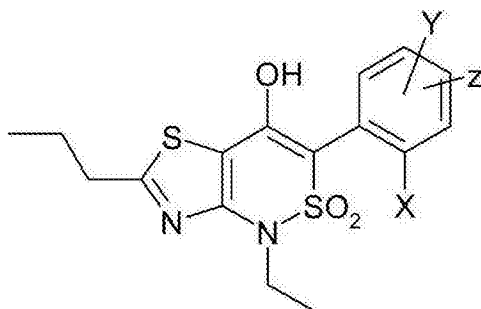
[0410] 表 130 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为乙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0411]



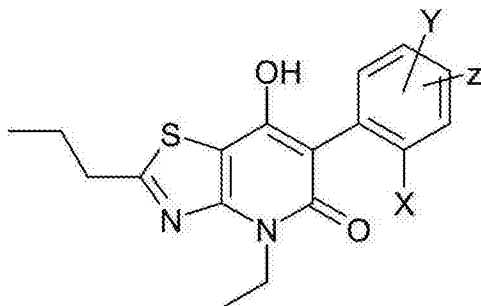
[0412] 表 131 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为正丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0413]



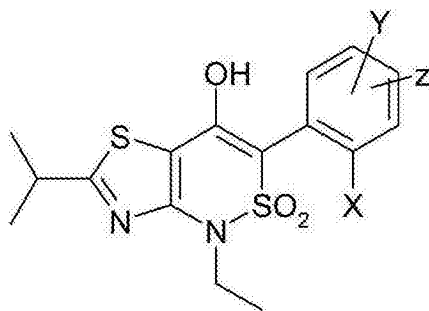
[0414] 表 132 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为正丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0415]



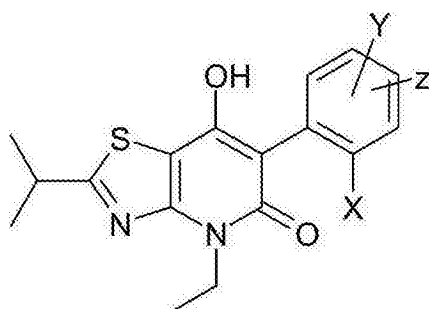
[0416] 表 133 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为异丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0417]



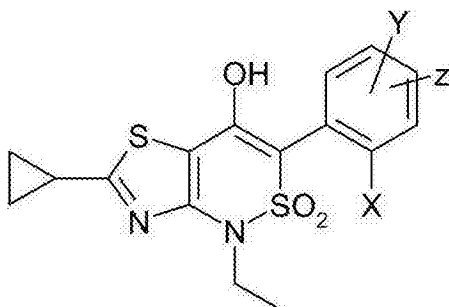
[0418] 表 134 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为异丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0419]



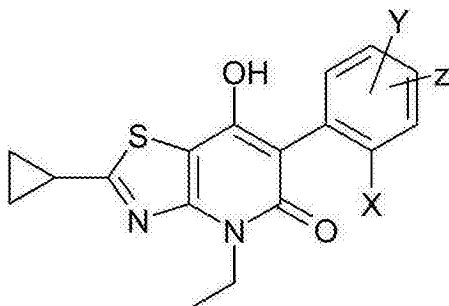
[0420] 表 135 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为环丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0421]



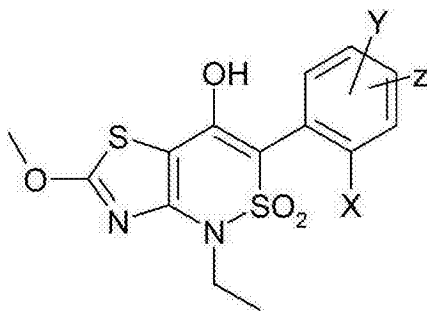
[0422] 表 136 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为环丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0423]



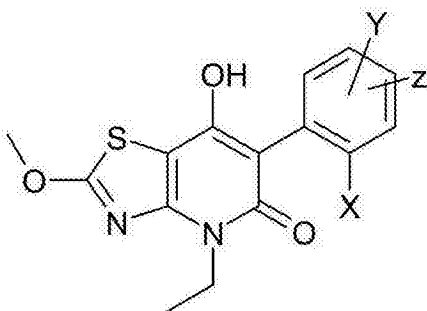
[0424] 表 137 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为甲氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0425]



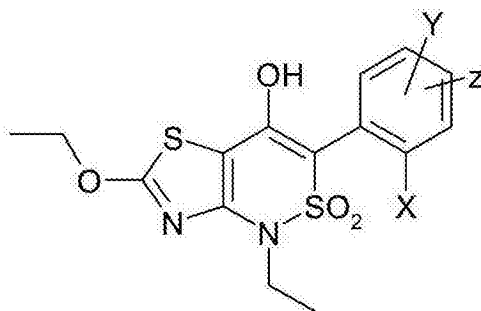
[0426] 表 138 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为甲氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0427]



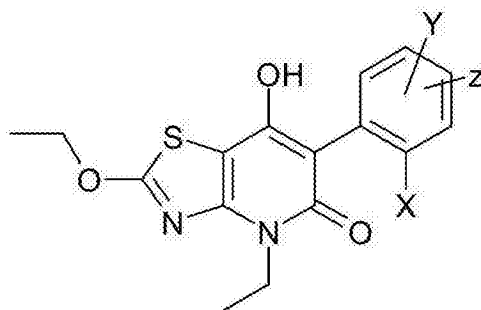
[0428] 表 139 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0429]



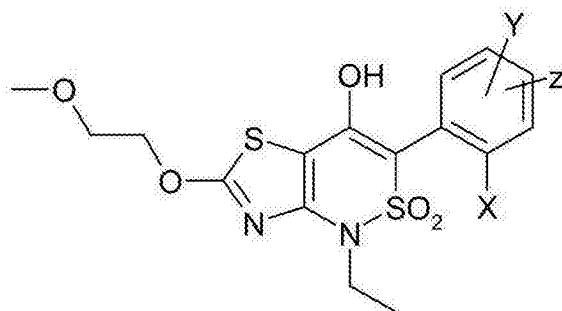
[0430] 表 140 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0431]



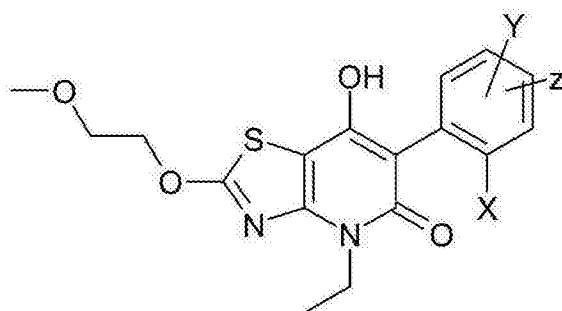
[0432] 表 141 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为甲氧基乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0433]



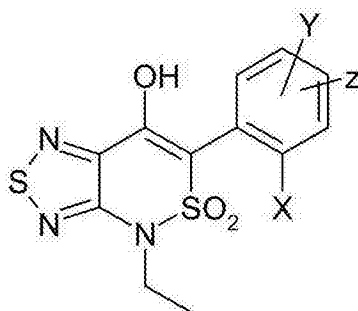
[0434] 表 142 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A2, R^{10} 为甲氧基乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0435]



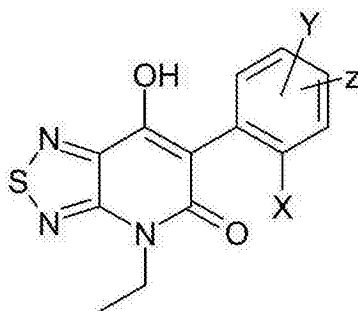
[0436] 表 143 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A12,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0437]



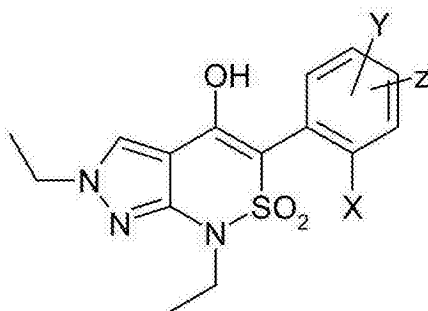
[0438] 表 144 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A12,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0439]



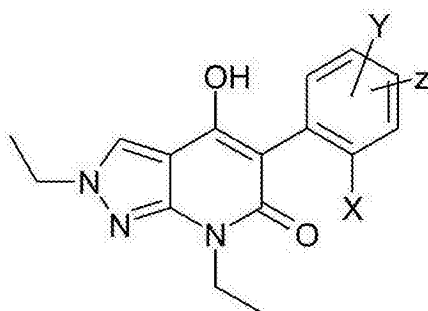
[0440] 表 145 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为乙基, A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为乙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0441]



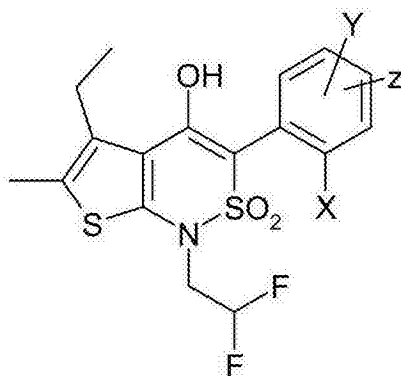
[0442] 表 146 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为乙基, A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为乙基, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0443]



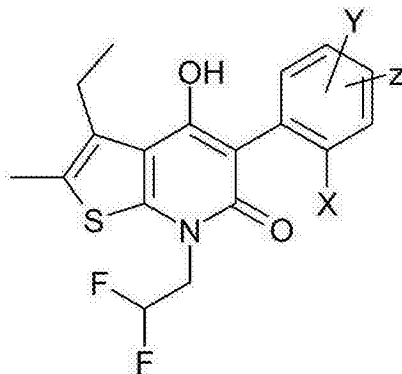
[0444] 表 147 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为 2,2-二氟乙基, A 为 A10, R^{12} 为乙基且 R^{13} 为甲基, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0445]



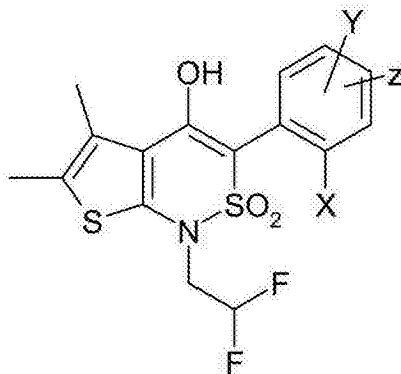
[0446] 表 148 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为 2,2-二氟乙基, A 为 A10, R^{12} 为乙基且 R^{13} 为甲基, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0447]



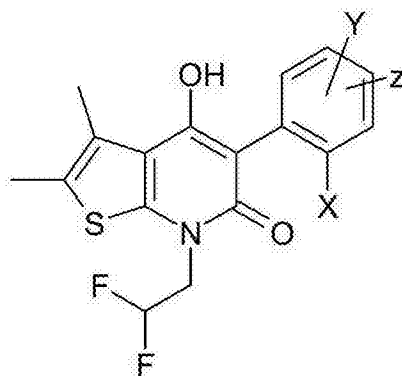
[0448] 表 149 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0449]



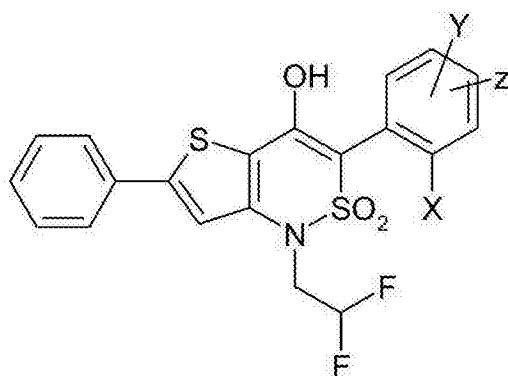
[0450] 表 150 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0451]



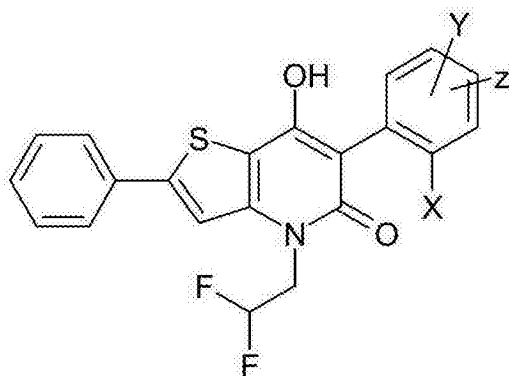
[0452] 表 151 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A7, R^{12} 为苯基且 R^{13} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0453]



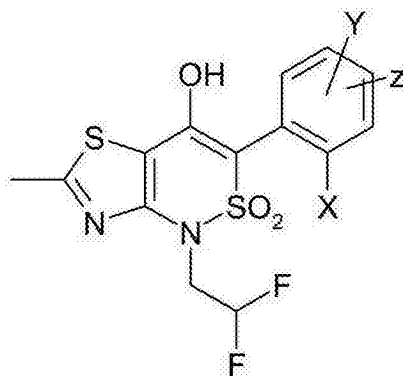
[0454] 表 152 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A10, R^{12} 为苯基且 R^{13} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0455]



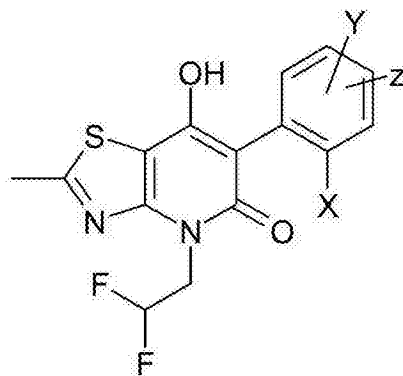
[0456] 表 153 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义 :

[0457]



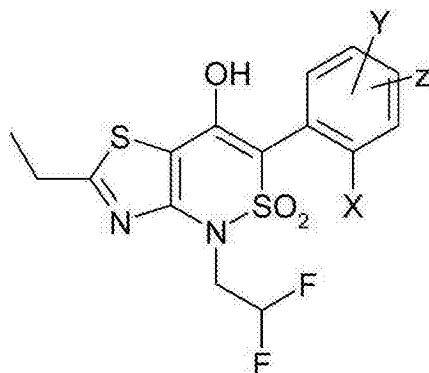
[0458] 表 154 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义 :

[0459]



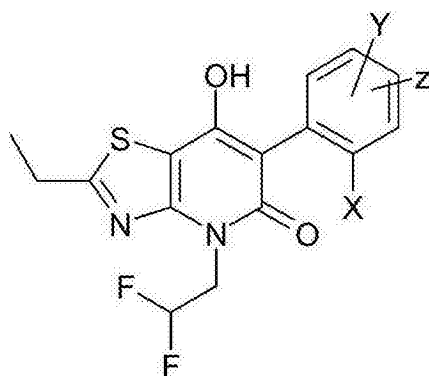
[0460] 表 155 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为乙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义 :

[0461]



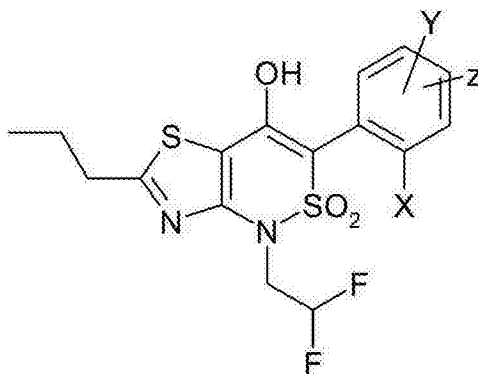
[0462] 表 156 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为乙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0463]



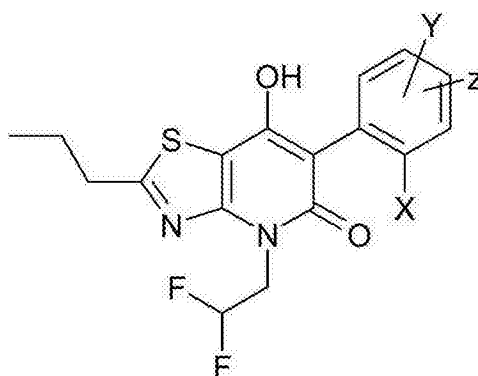
[0464] 表 157 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为正丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0465]



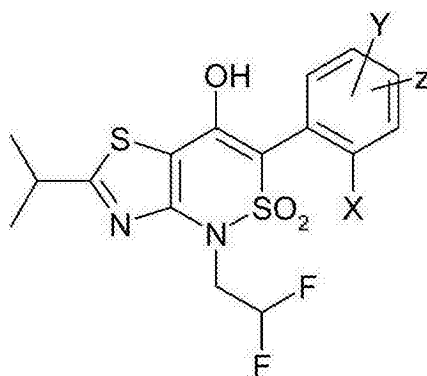
[0466] 表 158 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为正丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0467]



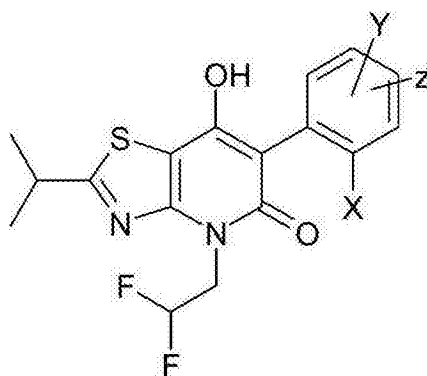
[0468] 表 159 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为异丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0469]



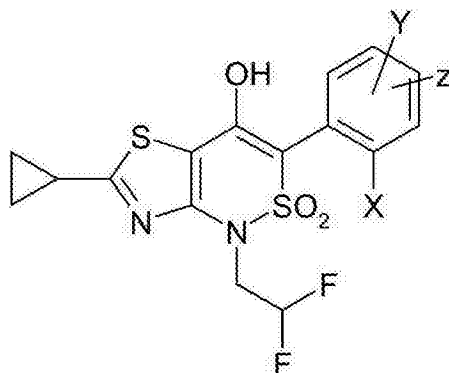
[0470] 表 160 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为异丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0471]



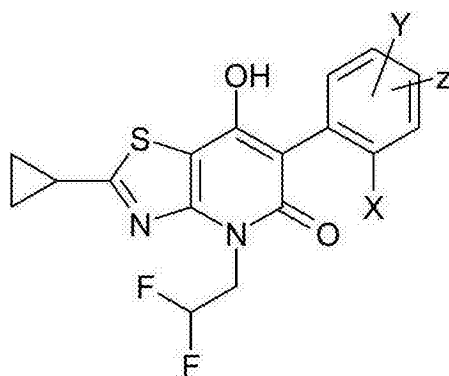
[0472] 表 161 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为环丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0473]



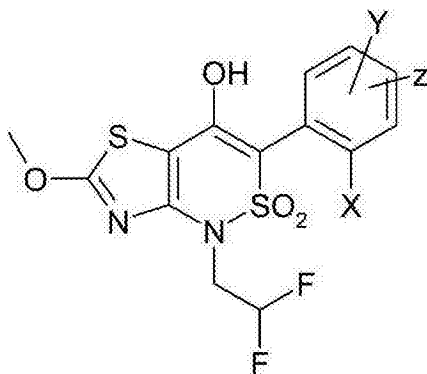
[0474] 表 162 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为环丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0475]



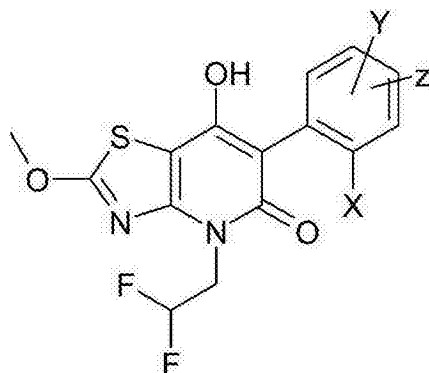
[0476] 表 163 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为甲氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0477]



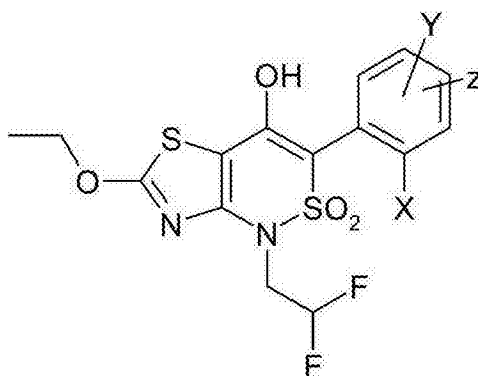
[0478] 表 164 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为甲氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0479]



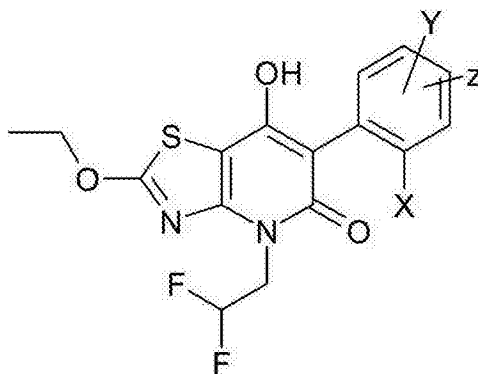
[0480] 表 165 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0481]



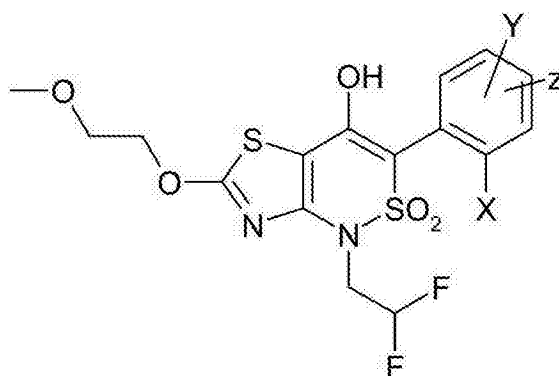
[0482] 表 166 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0483]



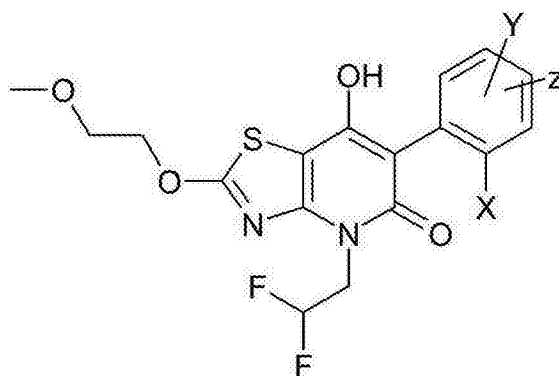
[0484] 表 167 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为甲氧基乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0485]



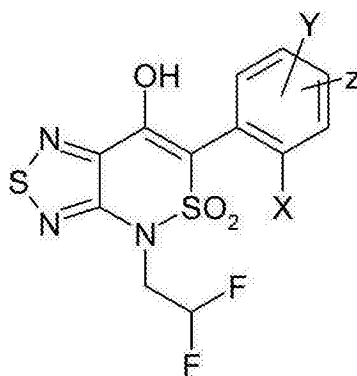
[0486] 表 168 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A2, R^{10} 为甲氧基乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0487]



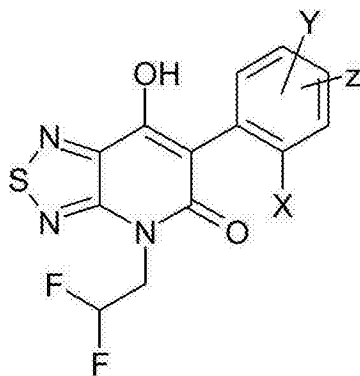
[0488] 表 169 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A12,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0489]



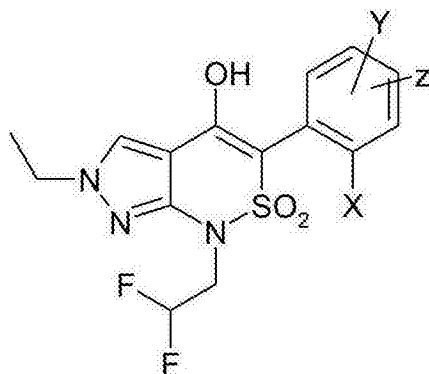
[0490] 表 170 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A12,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0491]



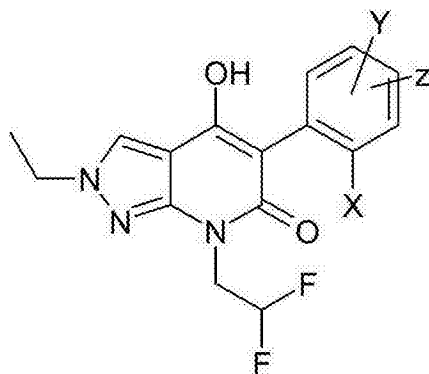
[0492] 表 171 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为乙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0493]



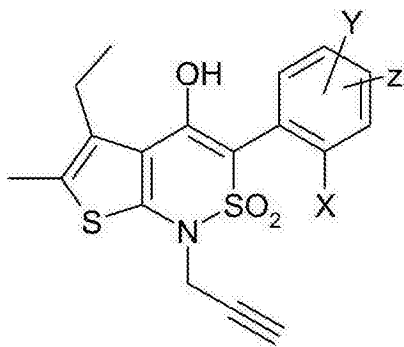
[0494] 表 172 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为 2,2- 二氟乙基,A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为乙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0495]



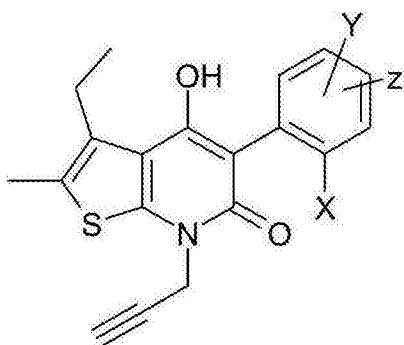
[0496] 表 173 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为丙炔基,A 为 A10, R^{12} 为乙基且 R^{13} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0497]



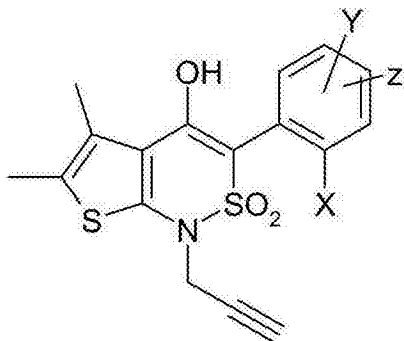
[0498] 表 174 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为丙炔基,A 为 A10, R^{12} 为乙基且 R^{13} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0499]



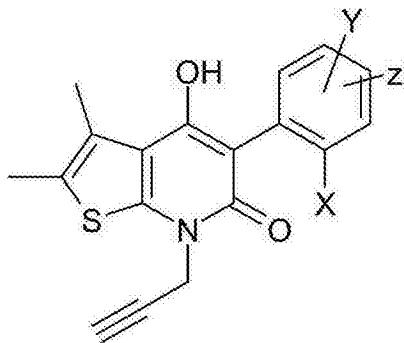
[0500] 表 175 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为丙炔基,A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0501]



[0502] 表 176 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $C=O$,W 为丙炔基,A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

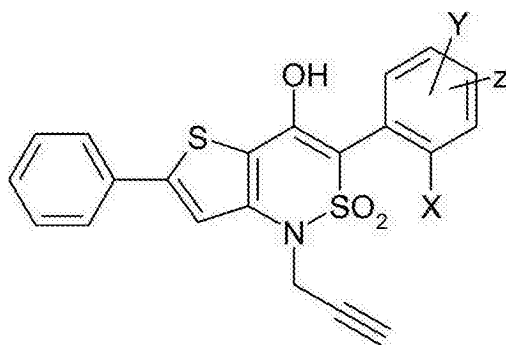
[0503]



[0504] 表 177 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为丙炔基,A 为 A7, R^{12}

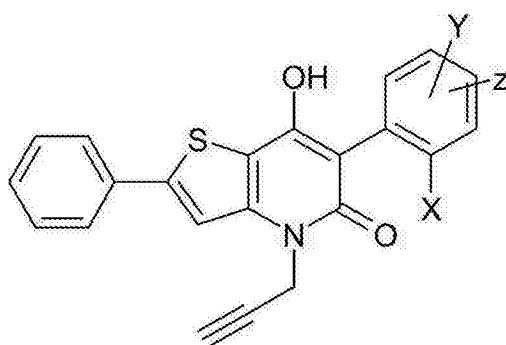
为苯基且 R^{13} 为氢, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0505]



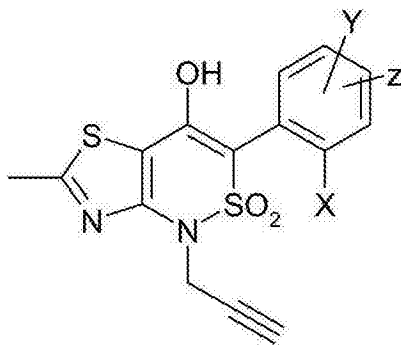
[0506] 表 178: 本发明的式 (I) 的化合物, 其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为丙炔基, A 为 A10, R^{12} 为苯基且 R^{13} 为氢, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0507]



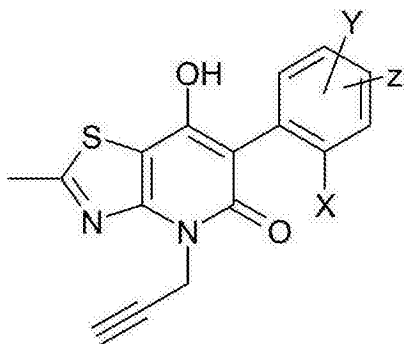
[0508] 表 179: 本发明的式 (I) 的化合物, 其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为丙炔基, A 为 A2, R^{10} 为甲基, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0509]



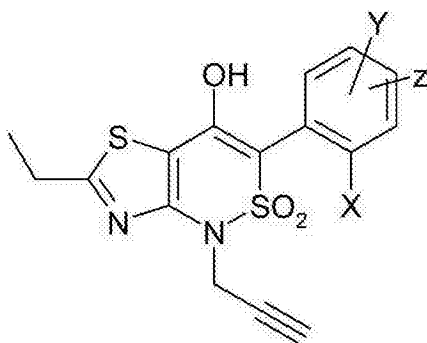
[0510] 表 180: 本发明的式 (I) 的化合物, 其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为丙炔基, A 为 A2, R^{10} 为甲基, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0511]



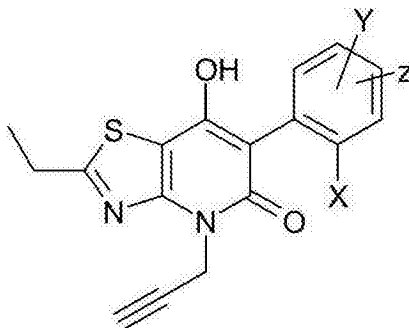
[0512] 表 181 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为丙炔基, A 为 A2, R^{10} 为乙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0513]



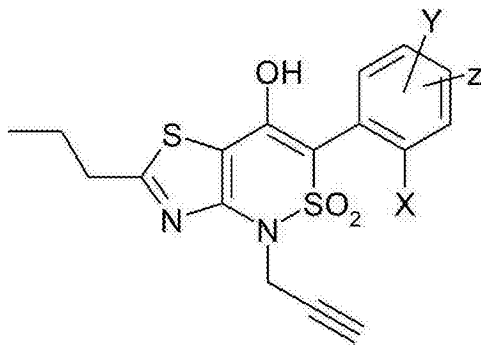
[0514] 表 182 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为丙炔基, A 为 A2, R^{10} 为乙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0515]



[0516] 表 183 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为丙炔基, A 为 A2, R^{10} 为正丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

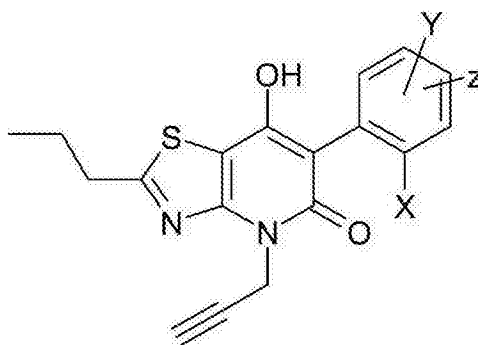
[0517]



[0518] 表 184 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为丙炔基, A 为 A2,

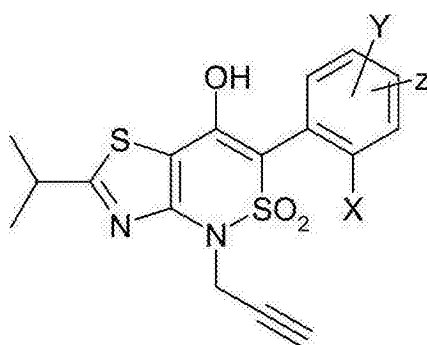
R¹⁰为正丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0519]



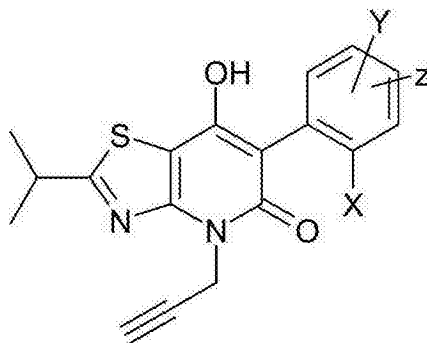
[0520] 表 185:本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO₂, W 为丙炔基, A 为 A2, R¹⁰为异丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0521]



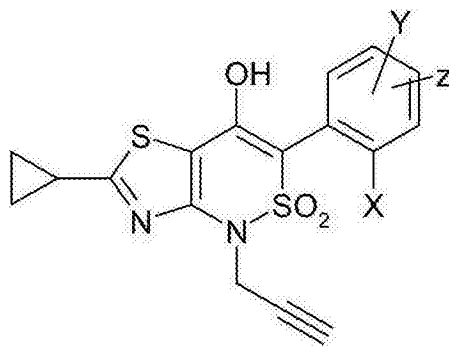
[0522] 表 186:本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 C=O, W 为丙炔基, A 为 A2, R¹⁰为异丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0523]



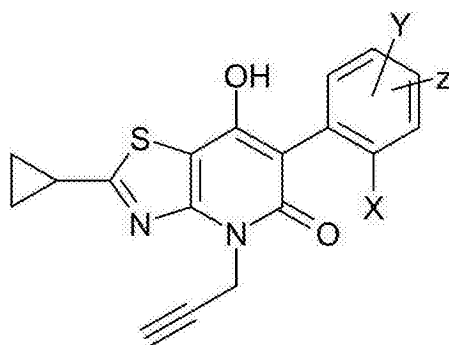
[0524] 表 187:本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO₂, W 为丙炔基, A 为 A2, R¹⁰为环丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0525]



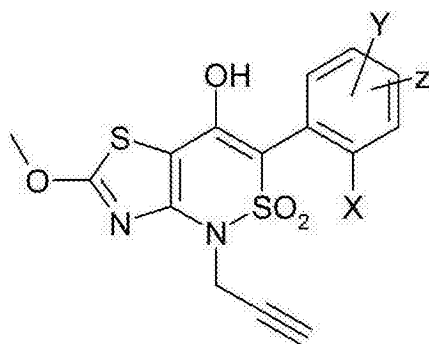
[0526] 表 188 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为丙炔基, A 为 A2, R^{10} 为环丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0527]



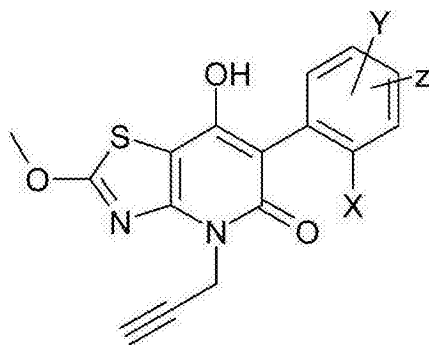
[0528] 表 189 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为丙炔基, A 为 A2, R^{10} 为甲氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0529]



[0530] 表 190 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为丙炔基, A 为 A2, R^{10} 为甲氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

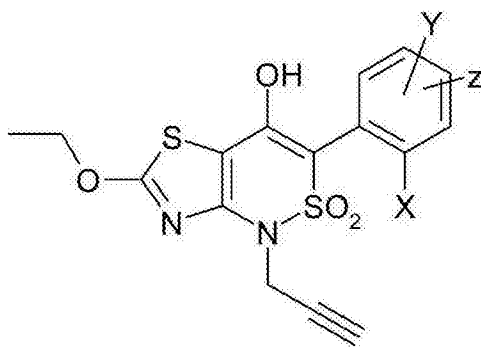
[0531]



[0532] 表 191 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为丙炔基, A 为 A2, R^{10}

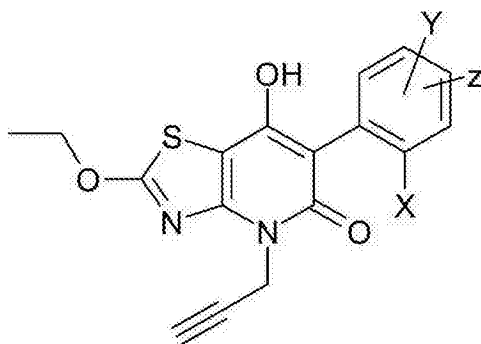
为乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0533]



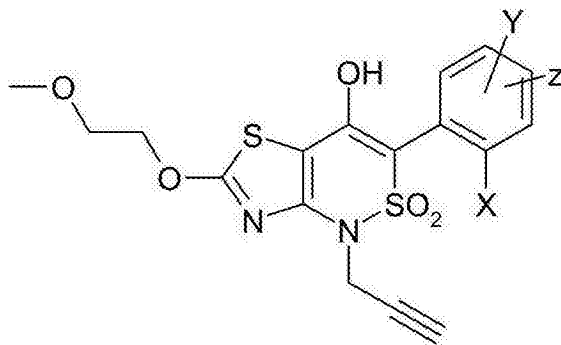
[0534] 表 192:本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为丙炔基, A 为 A2, R^{10} 为乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0535]



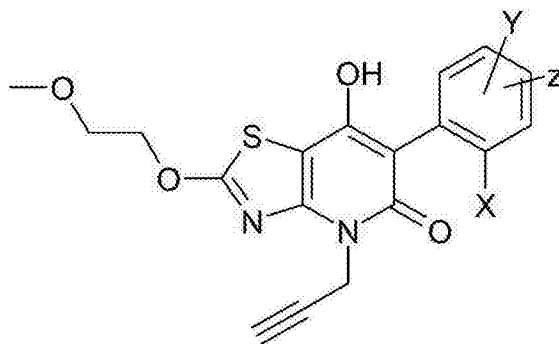
[0536] 表 193:本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为丙炔基, A 为 A2, R^{10} 为甲氧基乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0537]



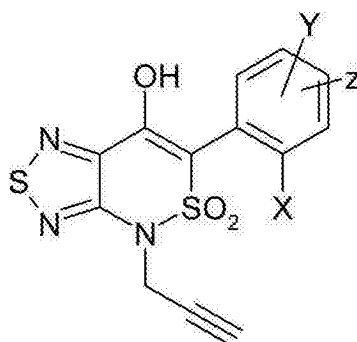
[0538] 表 194:本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为丙炔基, A 为 A2, R^{10} 为甲氧基乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0539]



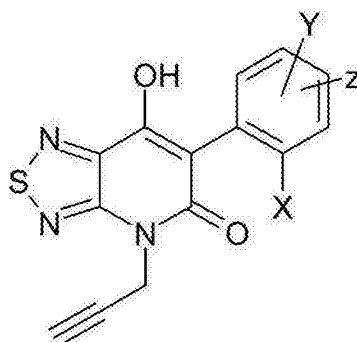
[0540] 表 195 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为丙炔基,A 为 A12,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0541]



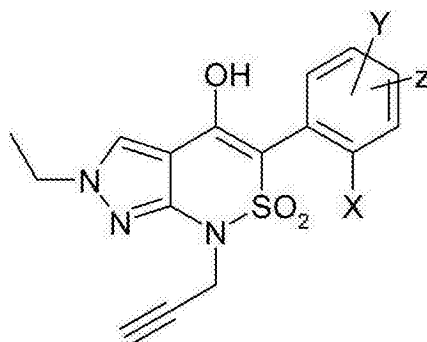
[0542] 表 196 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为丙炔基,A 为 A12,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0543]



[0544] 表 197 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为丙炔基,A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为乙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

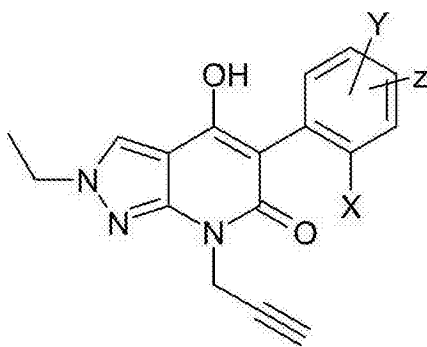
[0545]



[0546] 表 198 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为丙炔基,A 为 A6,

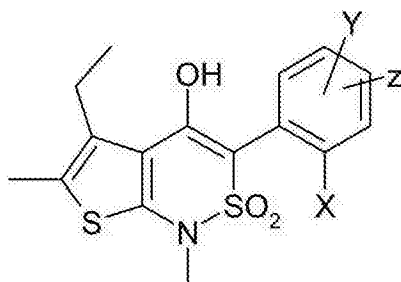
R^{12} 为氢, R^{14} 为乙基, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0547]



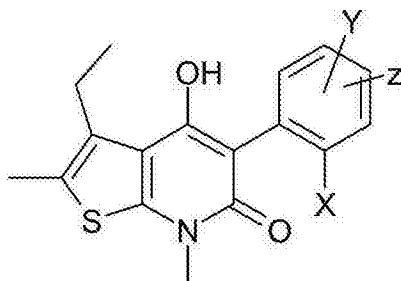
[0548] 表 199: 本发明的式 (I) 的化合物, 其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A10, R^{12} 为乙基且 R^{13} 为甲基, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0549]



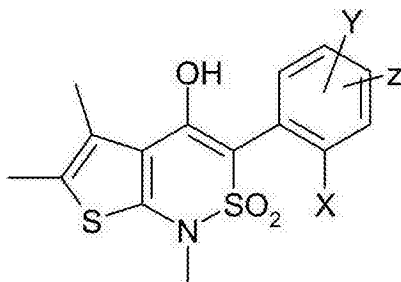
[0550] 表 200: 本发明的式 (I) 的化合物, 其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为甲基, A 为 A10, R^{12} 为乙基且 R^{13} 为甲基, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0551]



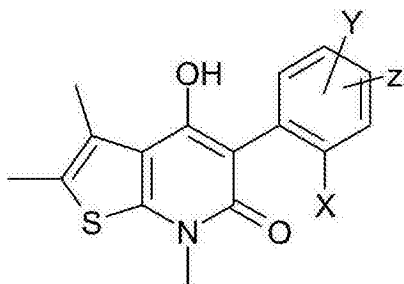
[0552] 表 201: 本发明的式 (I) 的化合物, 其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为甲基, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0553]



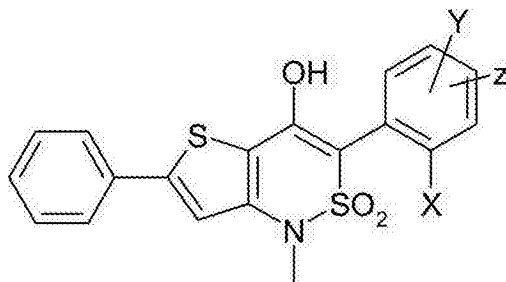
[0554] 表 202: 本发明的式 (I) 的化合物, 其中 G 为氢, V 为 $C=O$, W 为甲基, A 为 A10, R^{12} 和 R^{13} 各自为甲基, 并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0555]



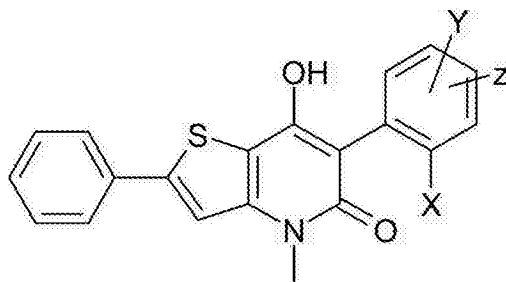
[0556] 表 203 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为甲基,A 为 A7, R^{12} 为苯基且 R^{13} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0557]



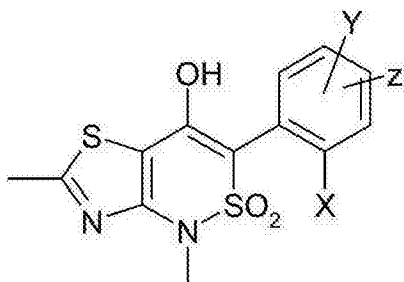
[0558] 表 204 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为甲基,A 为 A10, R^{12} 为苯基且 R^{13} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0559]



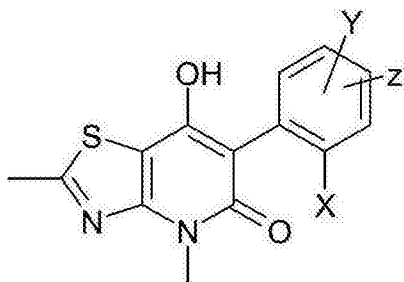
[0560] 表 205 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为甲基,A 为 A2, R^{10} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0561]



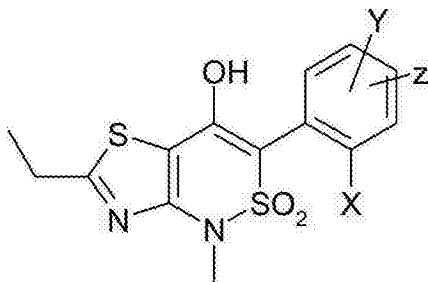
[0562] 表 206 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为甲基,A 为 A2, R^{10} 为甲基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0563]



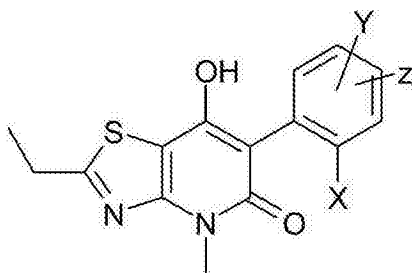
[0564] 表 207 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A2, R^{10} 为乙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0565]



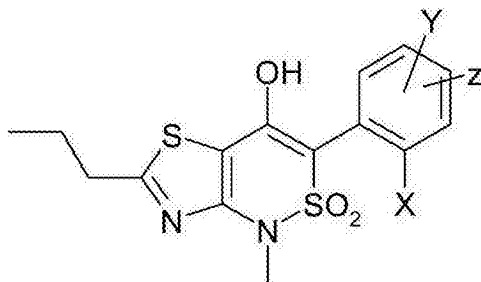
[0566] 表 208 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为甲基, A 为 A2, R^{10} 为乙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0567]



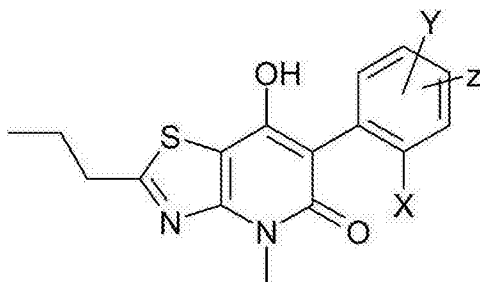
[0568] 表 209 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A2, R^{10} 为正丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0569]



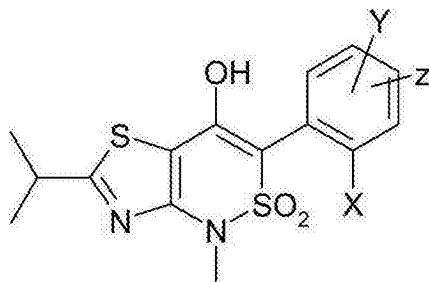
[0570] 表 210 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为甲基, A 为 A2, R^{10} 为正丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0571]



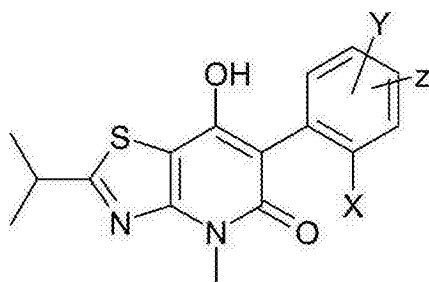
[0572] 表 211 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A2, R^{10} 为异丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0573]



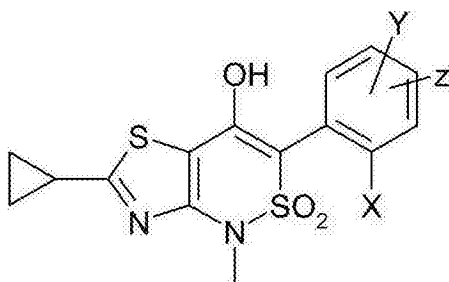
[0574] 表 212 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为甲基, A 为 A2, R^{10} 为异丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0575]



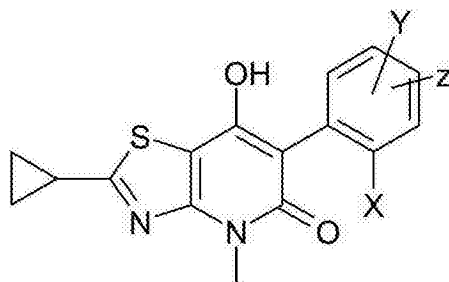
[0576] 表 213 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A2, R^{10} 为环丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0577]



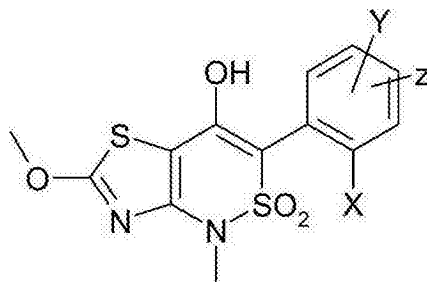
[0578] 表 214 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为甲基, A 为 A2, R^{10} 为环丙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0579]



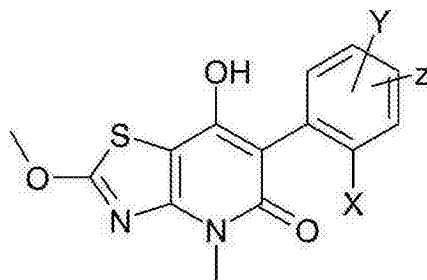
[0580] 表 215 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A2, R^{10} 为甲氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0581]



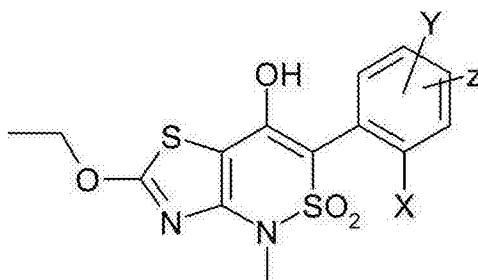
[0582] 表 216 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为甲基, A 为 A2, R^{10} 为甲氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0583]



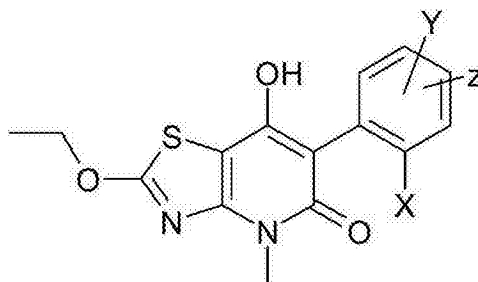
[0584] 表 217 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A2, R^{10} 为乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0585]



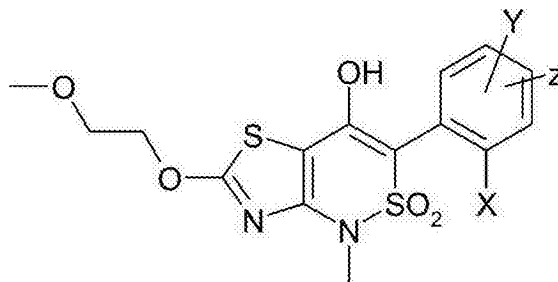
[0586] 表 218 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为甲基, A 为 A2, R^{10} 为乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0587]



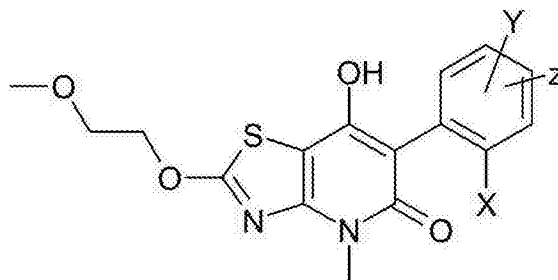
[0588] 表 219 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A2, R^{10} 为甲氧基乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0589]



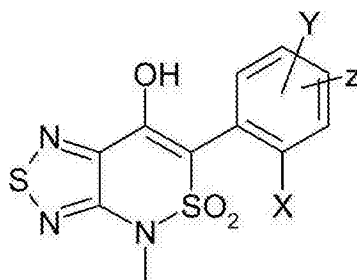
[0590] 表 220 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为甲基, A 为 A2, R^{10} 为甲氧基乙氧基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0591]



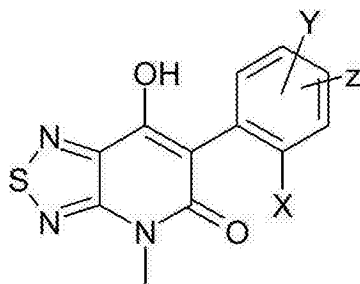
[0592] 表 221 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A12,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0593]



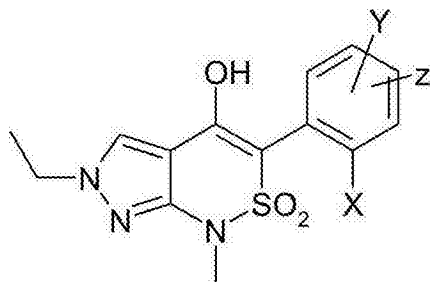
[0594] 表 222 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为甲基, A 为 A12,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0595]



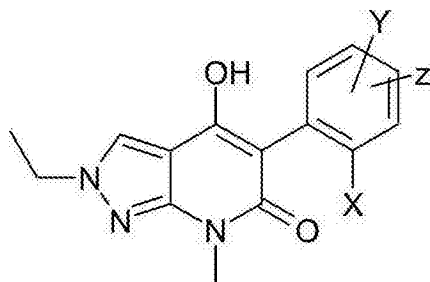
[0596] 表 223 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲基, A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为乙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0597]



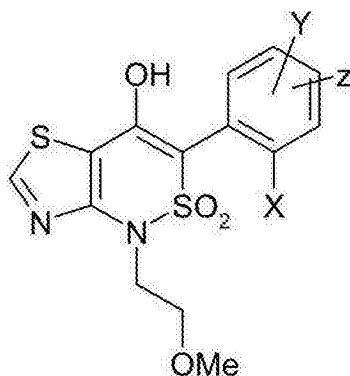
[0598] 表 224 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为甲基, A 为 A6, R^{12} 为氢, R^{14} 为乙基,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0599]



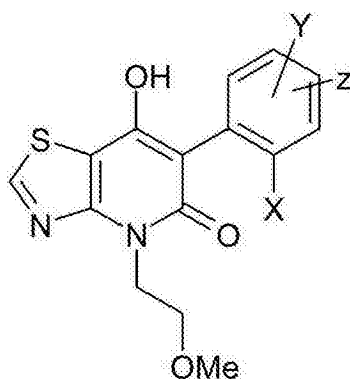
[0600] 表 225 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 SO_2 , W 为甲氧基乙基, A 为 A2, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0601]



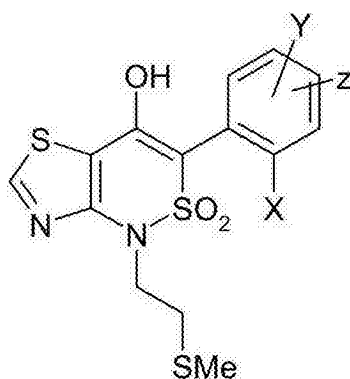
[0602] 表 226 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢, V 为 $\text{C}=\text{O}$, W 为甲氧基乙基, A 为 A2, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0603]



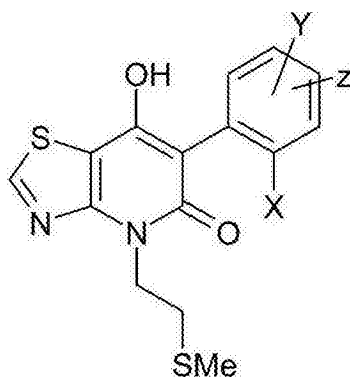
[0604] 表 227 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 SO_2 ,W 为甲硫基乙基,A 为 A2, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

[0605]



[0606] 表 228 :本发明的式 (I) 的化合物,其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$,W 为甲硫基乙基,A 为 A2, R^{10} 为氢,并且 X、Y 和 Z 各自为如表 1 所定义:

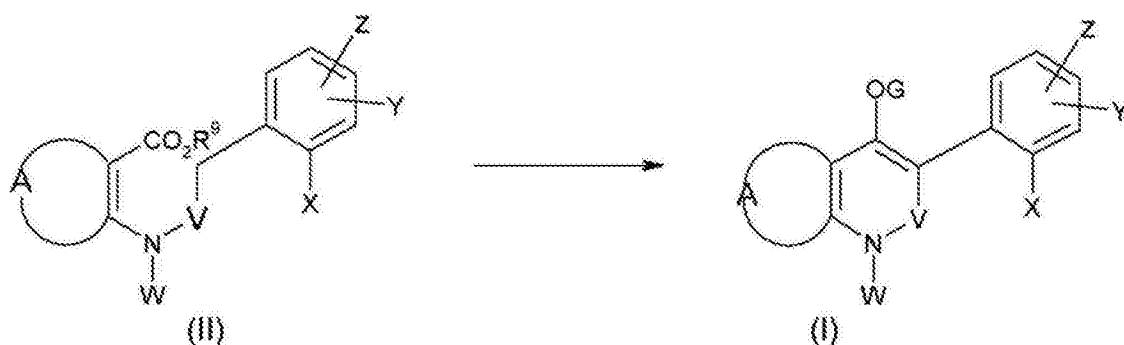
[0607]



[0608] 其中 G 为氢,V 为 $\text{C}=\text{O}$ 或 SO_2 的本发明的式 (I) 化合物可通过例如方案 1 中具体给出的方法,通过碱诱导的式 (II) 化合物的缩合反应来制备。此处, R^9 为 (C_1-C_6) 烷基,特别是甲基或乙基。

[0609] 方案 1

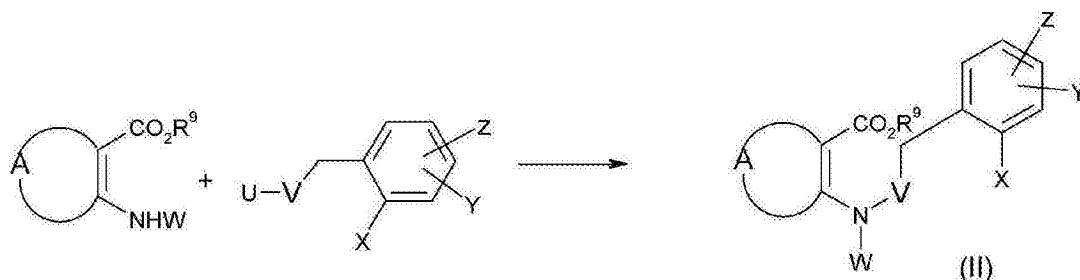
[0610]



[0611] 式 (II) 的化合物可例如根据方案 1a 具体给出的方法, 通过使氨基酸衍生物与苯基乙酸衍生物或苯磺酸衍生物反应来制备。此处, U 为通过羧酸活化试剂 (例如羰基二咪唑、羰基二亚胺 (例如二环己基碳二亚胺))、磷酸化试剂 (例如 POCl_3 、 BOP-Cl)、卤化剂 (例如亚硫酸氯、草酰氯、光气或氯甲酸酯) 而引入的离去基团。这类方法也可由本领域技术人员由 W02008/009908A1 和 W02008/071918A1 或 W02009/063180 和其中引用的文献中已知。式 (II) 的化合物为新的并且同样构成本发明主题的一部分。

[0612] 方案 1a

[0613]

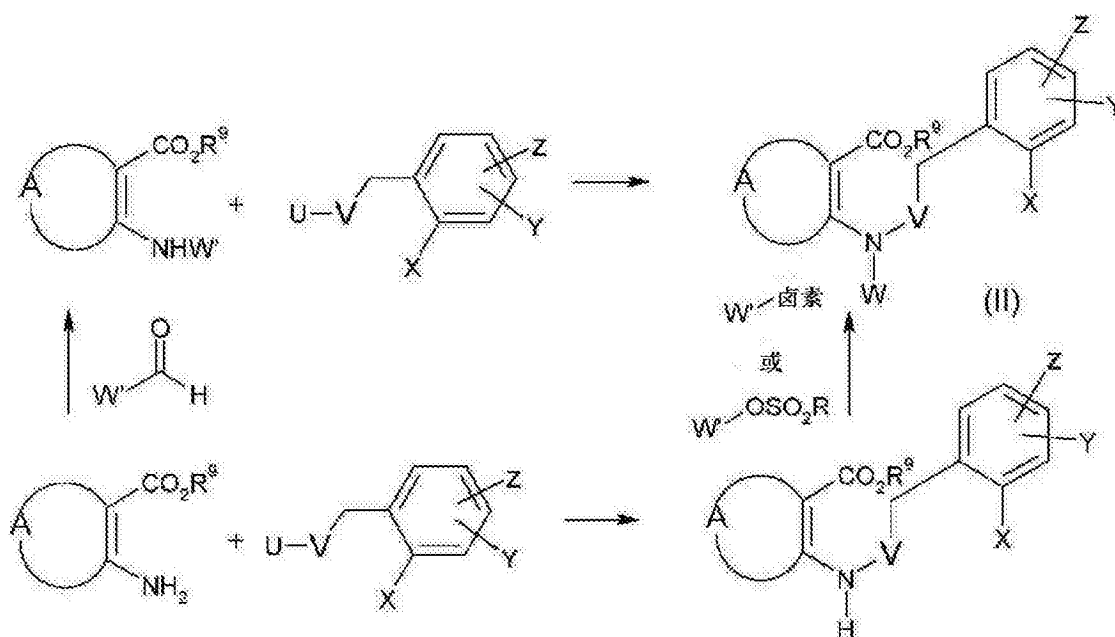


[0614] 制备方案 1a 中具体给定的苯基乙酸衍生物所需的游离苯基乙酸, 即其中 U 为羟基和 V 为 $\text{C}=\text{O}$ 的那些, 是已知的或者可通过本身已知的方法, 例如已知于 W02005/075401、W02001/96277、W01996/35664 和 W01996/25395 的方法来制备。在 W 为除氢之外的任意基团的情况下, W' 基团可通过文献已知的方法引入, 例如通过相应的氨基酸酯与醛的还原氨化, 随后用例如氰基硼氢化钠还原的方法。W' 为各自被 n 个卤原子取代的 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_3-C_6) 炔基、 (C_3-C_6) 环烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ 烷基、二 $-(\text{C}_1-\text{C}_4)$ 烷氧基 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ 烷基或 (C_1-C_4) 烷硫基 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ 烷基、 (C_3-C_6) 环烷基 $-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ 烷基。

[0615] 还已知 W' 卤化物或相应的磺酸酯与合适的氨基酸酯反应得到所需的前体。或者, 还相应地可以通过氨基酸酯与合适的苯基乙酸或苯磺酸完成缩合反应以进行 W' 卤化物或磺酸酯的烷基化 (见方案 1b), 其随后同样地得到本发明的中间体 II。

[0616] 方案 1b

[0617]



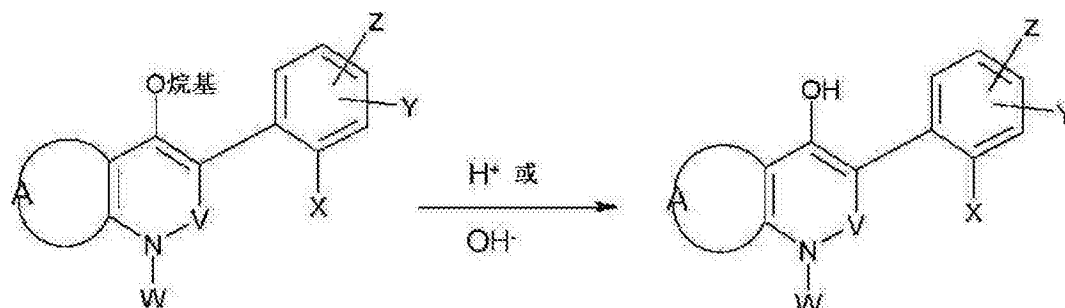
[0618] 特定的苯基乙酸衍生物也可用乙酸酯烯醇化物在例如由钯源（如 $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ 或 $\text{Pd}(\text{Oac})_2$ ）和配体（如 $(t\text{-Bu})_3\text{P}$ 、 $i\text{Mes} \cdot \text{HCl}$ 或 $2'-(\text{N}, \text{N}-\text{二甲基氨基})-2-(\text{二} \text{环己基磷基}) \text{联苯基}$ ）形成的钯催化剂的存在下制备（W02005/048710, J. Am. Chem. Soc2002. 124, . 12557, J. Am. Chem. Soc2003. 125, 11176 或 J. Am. Chem. Soc. 2001, 123, 799）。此外, 可以将特定的被取代的芳基卤化物在铜催化下转化成相应的被取代的丙二酸酯（例如记载于 Org. Lett. 2002, 2, 269, W02004/108727 中），该被取代的丙二酸酯可通过已知的方法转变成苯基乙酸。

[0619] 制备方案 1a 中具体给定的苄磺酸衍生物所需的游离苄磺酸, 即其中 U 为羟基和 V 为 SO_2 的那些, 是已知的或者可通过本身已知的方法, 例如已知于 W02009/063180 中的方法来制备。

[0620] 本发明的式 (I) 化合物（其中 G 为氢）也可例如通过方案 2 中具体给定的方法, 通过使 (I) 的化合物（其中 G 为烷基, 优选甲基）与强无机碱（例如氢氧化钠或氢氧化钾）反应、或者在浓无机酸（例如氢溴酸）中反应来制备。

[0621] 方案 2

[0622]



[0623] 本发明的式 (I) 化合物（其中 G 为 $\text{C}(=\text{O})\text{R}^1$ ）可例如通过本领域技术人员已知的、式 (I) 的化合物（其中 G 为氢）与式 $\text{HaI}-\text{CO}-\text{R}^1$ 的羰基卤化物或与式 $\text{R}^1-\text{CO}-\text{O}-\text{CO}-\text{R}^1$ 的羧酸酐的反应来制备。

[0624] 本发明的式 (I) 化合物（其中 G 为 $\text{C}(=\text{L})\text{MR}^2$ ）可例如通过本领域技术人员已知

的、式 (I) 的化合物 (其中 G 为氢) 与 a) 式 $R^2-M-COOR^1$ 的氯甲酸酯或硫代氯甲酸酯或与 b) 氯甲酰基卤化物或硫代氯甲酰基卤化物的反应来制备。

[0625] 本发明的式 (I) 化合物 (其中 G 为 SO_2R^3) 可例如通过本领域技术人员已知的、式 (I) 的化合物 (其中 G 为氢) 与式 R^3-SO_2-Cl 的磺酰氯的反应来制备。

[0626] 本发明的式 (I) 化合物 (其中 G 为 $P(=L)R^4R^5$) 可例如通过本领域技术人员已知的、式 (I) 的化合物 (其中 G 为氢) 与式 $Hal-P(=L)R^4R^5$ 的磷酰氯的反应来制备。

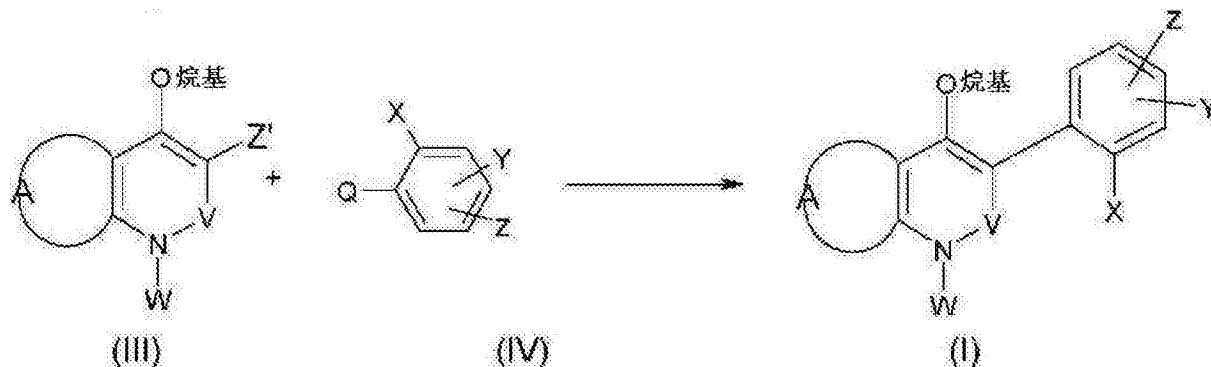
[0627] 本发明的式 (I) 化合物 (其中 G 为 E) 可以例如通过本领域技术人员已知的、式 (I) 的化合物 (其中 G 为氢) 与式 $Me(OR^{10})_t$ 的金属化合物或者与胺的反应来制备。此处, Me 为一价或二价金属离子, 优选碱金属或碱土金属, 例如锂、钠、钾、镁或钙。下标 t 为 1 或 2。铵离子为 NH_4^+ 或 $R^{13}R^{14}R^{15}R^{16}N^+$, 其中 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 和 R^{16} 优选各自独立地为 (C_1-C_6) 烷基或苄基。

[0628] 本发明的式 (I) 化合物 (其中 G 为 $C(=L)NR^6R^7$) 可以例如通过本领域技术人员已知的、式 (I) 的化合物 (其中 G 为氢) 与式 $R^6-N=C=L$ 的异氰酸酯或异硫氰酸酯或者与式 $R^6R^7N-C(=L)Cl$ 的氨基甲酰氯或硫代氨基甲酰氯的反应来制备。

[0629] 本发明的式 (I) 化合物 (其中 G 为烷基, 优选甲基) 也可例如根据方案 3, 通过本领域技术人员已知的、式 (III) 化合物与式 (IV) 化合物的反应来制备。此处, Z' 为溴或碘且 Q 为三烷基锡基团、卤化镁基团、或优选为硼酸或其酯。这些反应通常在催化剂 (例如 Pd 盐或 Pd 络合物) 的存在下和碱 (例如碳酸钠、磷酸钾) 的存在下进行。

[0630] 方案 3

[0631]



[0632] 可根据上文提及的反应合成的式 (I) 化合物和 / 或其盐的集合也可以平行的方式制备, 其可以手动、半自动或完全自动的方式进行。可例如使产品或中间体的反应、后处理或纯化的实施自动化。总之, 这应理解为表示例如由 D. Tiebes 在 Combinatorial Chemistry-Synthesis, Analysis, Screening(Editor Günther Jung), Wiley1999, 1 至 34 页中描述的过程。

[0633] 对于平行反应实施和后处理, 可以使用一系列市售可得的仪器, 例如购自 Barnstead International, Dubuque, Iowa52004-0797, USA 的 Calpyso 反应块, 或者购自 Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB11 3AZ, England 的反应站, 或者购自 Perkin Elmar, Waltham, Massachusetts02451, USA 的多探针自动工作站 (MultiPROBE Automated Workstation)。对于式 (I) 的化合物及其盐或制备过程中所获得的中间体的平行纯化, 可供使用的装置包括, 例如购自 ISCO, Inc., 4700Superior Street, Lincoln,

NE68504, USA 的色谱装置。

[0634] 所列装置导致模块化操作,其中各步骤均是自动化的,但所述步骤之间必须进行手动操作。这可以通过使用部分或全部一体化的自动化系统而避免,在所述系统中,特定的自动化模块由例如机器人(robot)操作。这类自动化系统可例如自 Caliper, Hopkinton, MA01748, USA 购得。

[0635] 各个或几个合成步骤的实施可通过使用聚合物负载的试剂/清除剂树脂得到支持。专业文献描述了一系列试验方案,例如在 ChemFiles, Vol. 4, No. 1, Polymer-Supported Scavengers 和 Reagents for Solution-Phase Synthesis(Sigma-Aldrich) 中。

[0636] 除了此处所描述的方法,式(I)的化合物及其盐可完全或部分地通过固相负载法(solid-phase-supported method)制备。为此,将所述合成或与适当操作相匹配的合成中的单个中间体或所有中间体与合成树脂结合。固相负载合成法在专业文献中,例如 Barry A. Bunin 在“The Combinatorial Index”, Academic Press, 1998, 及 Combinatorial Chemistry-Synthesis, Analysis, Screening(编辑 Günther Jung), Wiley, 1999 中有充分描述。固相负载合成法的使用可实施文献中已知的一系列方案,所述方案可以手动或自动化的方式依次进行。例如,所述反应可在购自 Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, USA 的微反应器中借助于 IRORI 技术来实施。

[0637] 在固相上及在液相中,实施单个或多个合成步骤可通过使用微波技术得到支持。专业文献,例如 Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry(编辑 C. O. Kappe 和 A. Stadler), Wiley publishers, 2005 中记载了一系列试验方案。

[0638] 根据本文所述方法进行的制备生成了以物质集合的形式的式(I)化合物及其盐,称为库(libraries)。本发明还涉及包含至少两种式(I)化合物和其盐的库。

[0639] 本发明的式(I)的化合物(和/或其盐),以下一起称为“本发明化合物”,对广谱的经济上重要的单子叶和双子叶一年生杂草植物具有优异的除草效力。所述活性物质还良好地防治由根茎、根状茎或其它多年生器官生芽的且难以防治的多年生杂草植物。

[0640] 因此本发明还提供一种防治不想要的植物或用于调节植物(优选在植物作物中)生长的方法,其中将一种或多种本发明化合物施用于植物(例如杂草植物,如单子叶或双子叶杂草或不想要的作物植物)、种子(例如谷粒、种子或无性繁殖体,如块茎或带芽的枝条部位)或植物生长区域(例如栽培区域)。在本文中,本发明的化合物可例如在种植前(如果合适,还通过引入土壤中)、出苗前或出苗后施用。将提及可由本发明化合物防治的各种代表性的单子叶和双子叶杂草植物群的实例,但不意欲限于所提及的具体属种。

[0641] 以下属的单子叶杂草植物:山羊草属(Aegilops)、冰草属(Agropyron)、剪股颖属(Agrostis)、看麦娘属(Alopecurus)、假剪股颖属(Apera)、燕麦属(Avena)、臂形草属(Brachiaria)、雀麦属(Bromus)、蒺藜草属(Cenchrus)、鸭跖草属(Commelina)、狗牙根属(Cynodon)、莎草属(Cyperus)、龙爪茅属(Dactyloctenium)、马唐属(Digitaria)、稗属(Echinochloa)、荸荠属(Eleocharis)、蟋蟀草属(Eleusine)、画眉草属(Eragrostis)、野黍属(Eriochloa)、羊茅属(Festuca)、飘拂草属(Fimbristylis)、异蕊花属(Heteranthera)、白茅属(Imperata)、鸭嘴草属(Ischaemum)、千金子属(Leptochloa)、黑麦草属(Lolium)、雨久花属(Monochoria)、黍属(Panicum)、雀稗属(Paspalum)、藨草属(Phalaris)、梯牧草属(Phleum)、早熟禾属(Poa)、筒轴茅属(Rottboellia)、慈姑属

(Sagittaria)、莞草属 (Scirpus)、狗尾草属 (Setaria)、高粱属 (Sorghum)。

[0642] 以下属的双子叶杂草: 白麻属 (Abutilon)、苋属 (Amaranthus)、豚草属 (Ambrosia)、单花葵属 (Anoda)、春黄菊属 (Anthemis)、蔷薇属 (Aphanes)、蒿属 (Artemisia)、滨藜属 (Atriplex)、雏菊属 (Bellis)、鬼针属 (Bidens)、芥属 (Capsella)、飞廉属 (Carduus)、决明属 (Cassia)、矢车菊属 (Centaurea)、藜属 (Chenopodium)、蓟属 (Cirsium)、旋花属 (Convolvulus)、曼陀罗属 (Datura)、山蚂蝗属 (Desmodium)、刺酸模属 (Emex)、糖芥属 (Erysimum)、大戟属 (Euphorbia)、鼬瓣花属 (Galeopsis)、牛膝菊属 (Galinsoga)、拉拉藤属 (Galium)、芙蓉属 (Hibiscus)、番薯属 (Ipomoea)、地肤属 (Kochia)、野芝麻属 (Lamium)、独行菜属 (Lepidium)、母草属 (Lindernia)、母菊属 (Matricaria)、薄荷属 (Mentha)、山黧属 (Mercurialis)、Mullugo、勿忘我属 (Myosotis)、罂粟属 (Papaver)、牵牛属 (Pharbitis)、车前属 (Plantago)、蓼属 (Polygonum)、马齿苋属 (Portulaca)、毛茛属 (Ranunculus)、萝卜属 (Raphanus)、焯菜属 (Rorippa)、节节菜属 (Rotala)、酸模属 (Rumex)、猪毛菜属 (Salsola)、千里光属 (Senecio)、田菁属 (Sesbania)、黄花稔属 (Sida)、白芥属 (Sinapis)、茄属 (Solanum)、苦苣菜属 (Sonchus)、尖瓣花属 (Sphenoclea)、繁缕属 (Stellaria)、蒲公英属 (Taraxacum)、葎苳属 (Thlaspi)、车轴草属 (Trifolium)、荨麻属 (Urtica)、婆婆纳属 (Veronica)、堇菜属 (Viola)、苍耳属 (Xanthium)。

[0643] 如果将本发明化合物在发芽前施用于土壤表面,则杂草幼苗的出苗被完全阻止,或者杂草生长至其达到子叶期,但然后其停止生长,并最终在三至四周后彻底死亡。

[0644] 当将所述活性成分于出苗后施用于绿色植物部位时,在处理后的生长停止,并且杂草植物停留在施用时的生长期,或在一段时间后彻底死亡,从而在极早的阶段以持久的方式消除杂草——对作物植物有害的——的竞争。

[0645] 尽管本发明的化合物对单子叶和双子叶杂草具有显著的除草活性,但对经济上重要的作物植物,例如以下属的双子叶作物:落花生属 (Arachis)、甜菜属 (Beta)、芸苔属 (Brassica)、黄瓜属 (Cucumis)、南瓜属 (Cucurbita)、向日葵属 (Helianthus)、胡萝卜属 (Daucus)、大豆属 (Glycine)、棉属 (Gossypium)、番薯属 (Ipomoea)、莴苣属 (Lactuca)、亚麻属 (Linum)、番茄属 (Lycopersicon)、烟草属 (Nicotiana)、菜豆属 (Phaseolus)、豌豆属 (Pisum)、茄属 (Solanum)、蚕豆属 (Vicia);或以下属的单子叶作物:葱属 (Allium)、凤梨属 (Ananas)、天门冬属 (Asparagus)、燕麦属 (Avena)、大麦属 (Hordeum)、稻属 (Oryza)、黍属 (Panicum)、甘蔗属 (Saccharum)、黑麦属 (Secale)、高粱属 (Sorghum)、小黑麦属 (Triticale)、小麦属 (Triticum)、玉蜀黍属 (Zea),特别是玉蜀黍属和小黑麦属,仅具有微小程度的损害或完全没有损害,这取决于具体的本发明化合物的结构及其施用率。基于这些原因,本发明化合物高度适于选择性防治植物作物(例如农业上有用的植物或观赏植物)中不想要的植物生长。

[0646] 此外,本发明的化合物(取决于其具体的结构及施用的施用率)对作物植物具有显著的生长调节性质。它们以调节的方式参与植物自身的代谢并因此可用于受控的影响植物成分并便于收割,例如通过触发干燥和矮化生长。此外,它们还适合广泛防治和抑制不想要的营养生长(vegetative growth),而在此过程中不损害植物。抑制营养生长在许多单子叶和双子叶作物中起重要作用,因为例如这可减少或完全防止倒伏。

[0647] 由于所述活性成分的除草和植物生长调节性质,其也可用于防治已知的基因改性植物作物中或已经发展为基因改性的植物作物中的杂草植物。一般而言,转基因植物的特征为具有特定的有利特性,例如对某些农药的抗性,主要是对某些除草剂的抗性;对植物病害或植物病害病原体的抗性,例如对某些昆虫或微生物(如真菌、细菌或病毒)的抗性。其它特定的性质涉及例如采收物的数量、品质、储藏性、组成及特定成分。因此,淀粉含量提高的或淀粉品质改变的转基因植物或者其采收物具有不同脂肪酸组成的转基因植物是已知的。其它特定的性质可以为对非生物应激(例如热、冷、干旱、盐和紫外线辐射)的耐受性或者抗性。

[0648] 优选将本发明的式(I)化合物或其盐用于经济上重要的有用植物和观赏植物的转基因作物,所述作物例如谷类,例如小麦、大麦、黑麦、燕麦、高粱和黍、稻、木薯和玉米;或其他作物,例如甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、番茄、豌豆和其他蔬菜。

[0649] 优选将式(I)化合物作为除草剂用于有用植物作物中,所述有用植物对所述除草剂的植物毒性效应具有抗性,或者已通过重组方式而对其具有抗性。

[0650] 产生与现有植物相比具有改变的特性的新植物的常规方法有,例如传统育种方法和产生突变体。或者,具有改变的特征的新植物可借助重组方法产生(参见,例如EP0221044、EP0131624)。例如,描述了下列几种情形:

[0651] - 对作物植物的重组改性,目的在于将植物中合成的淀粉改性(例如W092/11376A、W092/14827A、W091/19806A),

[0652] - 对草铵膦(glufosinate)类(参见例如,EP0242236A、EP242246A)或草甘膦(glyphosate)类(W092/00377A)或磺酰脲类(EP0257993A、US5013659A)的某些除草剂具有抗性的转基因作物植物,或借助基因叠加(gene stacking)对这些除草剂的结合物或混合物具有抗性,例如,转基因作物植物,如商标或名称为OptimumTMGATTM(草甘膦ALS耐受)的玉米或大豆,

[0653] - 能够产生苏云金芽孢杆菌(*Bacillus thuringiensis*)毒素(Bt毒素)从而使植物对某些害虫具有抗性的转基因作物植物,例如棉花(EP0142924A、EP0193259A),

[0654] - 具有改变的脂肪酸组成的转基因作物植物(W091/13972A),

[0655] - 具有新的成分或次级代谢产物(secondary metabolite)(例如新的植物抗毒素,其带来抗病性的提高)的基因改性作物植物(EP309862A、EP0464461A),

[0656] - 光呼吸作用降低的基因改性植物,其特征为具有更高的产率和更高的应激耐受性(EP0305398A),

[0657] - 产生药学上或诊断上重要的蛋白质(“分子药耕(molecular pharming)”)的转基因作物植物,

[0658] - 以更高的产率或更好的品质为特征的转基因作物植物,

[0659] - 以例如上述新特性的结合(“基因叠加(gene stacking)”)为特征的转基因作物植物。

[0660] 可产生具有改变特性的新转基因植物的许多分子生物技术原则上是已知的;见例如I.Potrykus和G. Spangenberg(eds.)*Gene Transfer to Plants*, Springer Lab Manual(1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg. 或Christou,“Trends in Plant Science”1(1996)423-431)。

[0661] 为进行此类重组操作,可将核酸分子引入质粒,其能够通过重组 DNA 序列而产生突变或序列改变。例如,可借助标准方法进行碱基置换、部分序列移除或者加入天然或合成的序列。为了将 DNA 片段彼此连接,可以在片段上加入衔接头或连接体;见,例如 Sambrook et al.,1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*,2nd ed., Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY;或者 Winnacker “Gene and Klone”, VCH Weinheim2nd ed.,1996。

[0662] 例如,基因产物活性降低的植物细胞的制备可通过下列方法实现:通过表达至少一种用于实现共抑制效应的相应的反义 RNA 或正义 RNA,或者通过表达至少一种相应构建的特异性切割上述基因产物的转录物的核酶。

[0663] 为此,可首先使用含有基因产物的所有编码序列(包括可能存在的任何侧翼序列)的 DNA 分子,或使用仅含有部分编码序列的 DNA 分子,这些部分必须足够长,以便在细胞中产生反义作用。也可使用与基因产物的编码序列具有高度同源性但并不完全相同的 DNA 序列。

[0664] 当在植物中表达核酸分子时,合成的蛋白质可位于植物细胞的任意区室中。但为实现在具体区室中的定位,可例如使编码区域与确保在特定区室中定位的 DNA 序列连接。此类序列是技术人员已知的(参见,例如 Braun et al., *EMBO J.* 11(1992),3219-3227; Wolter et al., *Proc. Natl. Acad. Sci. USA*85(1988),846-850; Sonnewald et al., *Plant J.* 1(1991),95-106)。所述核酸分子还可在植物细胞的细胞器中表达。

[0665] 转基因植物细胞可通过已知技术再生以得到整株植物。原则上,转基因植物可以是任意植物种的植物,即既可以是单子叶植物,也可以是双子叶植物。

[0666] 因此,可得到特征在于由于过表达、阻抑或抑制同源(=天然)基因或基因序列、或者表达异源(=外源)基因或基因序列而具有改变的特性的转基因植物。

[0667] 优选将本发明的式(I)化合物用于对以下物质具有抗性的转基因作物中:生长调节剂,例如 2,4D、麦草畏(dicamba);或抑制基本的植物酶的除草剂,所述植物酶例如乙酰胺合酶(ALS)、EPSP 合酶、谷氨酰胺合酶(GS)或羟苯丙酮酸双加氧酶(HPPD);或选自磺酰脲、草甘膦、草铵膦或苯甲酰基异噁唑类和类似活性成分或这些活性成分的任意结合物的除草剂。

[0668] 可更优选将本发明的化合物用于转基因作物植物中,所述植物对草甘膦和草铵膦的结合物、草甘膦和磺酰脲或咪唑啉酮的结合物有抗性。特别优选将本发明的化合物用于转基因作物植物中,例如商标或名称为 OptimumTMGATTM(草甘膦 ALS 耐受)的玉米或大豆。

[0669] 当本发明活性物质用于转基因作物时,除了可在其它作物中观察到的对杂草植物的效果之外,在施用于所述转基因作物还常常观察到特异性的效果,例如改变的或特别是拓宽的可防治的杂草谱、改变的施用时可使用的施用率、优选地与转基因作物对其具有抗性的除草剂的良好相容性以及转基因作物植物的生长和产率的影响。

[0670] 本发明因此还提供本发明的式(I)化合物作为除草剂用于防治转基因作物植物中杂草植物的用途。

[0671] 本发明的化合物可以可湿性粉剂、乳油(emulsifiable concentration)、可喷雾溶液剂、粉末剂或颗粒剂形式在常规制剂中使用。因此,本发明还提供了包含本发明化合物的除草组合物和植物生长调节组合物。

[0672] 根据所需的生物学和 / 或物理化学参数,本发明的化合物可以多种方式配制。可能的剂型包括,例如:可湿性粉剂 (WP)、水溶性粉剂 (SP)、水溶性浓缩剂、乳油 (EC)、乳剂 (EW) (例如水包油乳剂和油包水乳剂)、可喷雾溶液剂、悬浮浓缩剂 (SC)、油基或水基分散剂、油混溶性溶液剂、胶囊悬浮剂 (CS)、粉末剂 (DP)、拌种产品、用于播撒和土壤使用的颗粒剂、微粒形式的颗粒剂 (GR)、喷雾颗粒剂、包衣颗粒剂和吸附颗粒剂、水分散性颗粒剂 (WG)、水溶性颗粒剂 (SG)、ULV 制剂、微胶囊剂和蜡剂。

[0673] 所述各种剂型原则上是已知的,并在例如下列文献中有所描述: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie" [Chemical technology], Volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th Ed., 1986; Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N. Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed., 1979, G. Goodwin Ltd. London.

[0674] 必需的制剂助剂——例如惰性物质、表面活性剂、溶剂和其他添加剂——也是已知的并在例如下列文献中有描述: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N. J., H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry"; 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N. Y.; C. Marsden, "Solvents Guide"; 2nd Ed., Interscience, N. Y. 1963; McCutcheon's "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N. J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N. Y. 1964; **Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte"** [Interface-active ethylene oxide adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th Ed., 1986.

[0675] 基于这些制剂,也可制备与其它农药活性物质 (例如杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂、杀真菌剂) 的结合物,以及与安全剂、肥料和 / 或生长调节剂的结合物,例如,以最终制剂 (finished formulation) 形式或作为桶混物。合适的安全剂为,例如,吡啶解草酯 (mefenpyr-diethyl)、环丙磺酰胺 (Cyprosulfamide)、双苯噁唑酸、解毒啉和烯丙酰草胺 (dichlormid)。

[0676] 可湿性粉剂为可均匀分散于水中的制剂,其除了含有活性物质之外、稀释剂或惰性物质之外,还含有离子型和 / 或非离子型表面活性剂 (润湿剂、分散剂),例如聚氧乙基化烷基酚、聚氧乙基化脂肪醇、聚氧乙基化脂肪胺、脂肪醇聚乙二醇醚硫酸盐、烷基苯磺酸盐、木素磺酸钠、2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸钠、二丁基萘磺酸钠或油酰基甲基牛磺酸钠。为了制备可湿性粉剂,例如将活性除草成分在常规设备如锤磨机、鼓风式研磨机 (blower mill) 和空气喷射式研磨机 (air-jet mill) 中磨细,并同时或随后与制剂助剂混合。

[0677] 乳油通过下述过程制备:将活性成分溶于有机溶剂 (例如丁醇、环己酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或者沸点较高的芳香族化合物或烃类,或有机溶剂的混合物) 中,加入一种或多种离子型和 / 或非离子型表面活性剂 (乳化剂)。使用的乳化剂的实例有:烷基芳基磺酸钙,例如十二烷基苯磺酸钙;或非离子型乳化剂,例如脂肪酸聚乙二醇酯、烷基芳基聚乙二醇醚、脂肪醇聚乙二醇醚、环氧丙烷-环氧乙烷缩合物、烷基聚醚、脱水山梨糖醇酯 (例如脱水山梨糖醇脂肪酸酯,或聚氧乙烯脱水山梨糖醇酯如聚氧乙烯脱水山梨糖醇脂肪酸酯)。

[0678] 粉末剂通过研磨活性成分和细分散的固体物质获得,所述固体物质例如滑石、天然粘土(如高岭土、膨润土和叶蜡石)或硅藻土。

[0679] 悬浮浓缩剂可为水基的或油基的。它们可以通过使用市售可得的砂磨机并任选加入例如已在上文其它制剂类型中所列的表面活性剂进行湿磨来制备。

[0680] 乳剂,例如水包油乳剂(EW),可以例如通过搅拌器、胶体磨和/或静态混合器用水性有机溶剂和任选地例如已在上文其它制剂类型中所列的表面活性剂来制备。

[0681] 颗粒剂可以通过将所述活性成分喷洒在吸附性的颗粒状惰性物质上、或通过粘合剂(例如聚乙烯醇、聚丙烯酸钠或矿物油)将活性成分浓缩物施用于载体表面而制备,所述载体例如砂、高岭土或颗粒状惰性物质。也可以将合适的活性成分以制备肥料颗粒的常规方式——如果需要与肥料混合——制备成颗粒。

[0682] 水分散性颗粒剂通常通过常规方法制备,所述常规方法例如喷雾干燥、流化床造粒、盘式造粒(pan granulation)、高速混合器混合和在无固体惰性物质的情况下挤出。

[0683] 对于盘式造粒、流化床造粒、挤出机造粒和喷雾造粒,参见例如以下文献中的方法:“Spray-Drying Handbook”第3版1979, G. Goodwin Ltd., London; J. E. Browning, “Agglomeration”, Chemical and Engineering 1967, 第147页及后; “Perry’s Chemical Engineer’s Handbook”, 第5版, McGraw-Hill, New York 1973, 第8-57页。

[0684] 有关作物保护组合物制剂的其他详细内容,参见例如 G. C. Klingman, “Weed Control as a Science”, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, 81-96页 和 J. D. Freyer, S. A. Evans, “Weed Control Handbook”, 第5版, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, 101-103页。

[0685] 农业化学制剂通常含有0.1-99重量%、特别是0.1-95重量%的本发明化合物。

[0686] 在可湿性粉剂中,活性成分浓度为例如约10-90重量%,至100重量%的余量物由常规制剂组分构成。在乳油的情况下,活性成分浓度可为约1-90重量%、优选5-80重量%。粉末状制剂含有1-30重量%的活性成分、经常优选5-20重量%的活性成分,可喷雾溶液含有约0.05-80重量%、优选2-50重量%的活性成分。在水分散性颗粒剂的情况下,活性成分含量部分地取决于活性化合物以液体还是固体形式存在以及使用何种造粒助剂、填充剂等。在水分散性颗粒剂的情况下,其活性成分含量为例如1-95重量%、优选10-80重量%。

[0687] 此外,提及的活性成分制剂任选地含有各种常规粘合剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、防冻剂和溶剂、填充剂、载体和染料、消泡剂、蒸发抑制剂以及影响pH或粘度的试剂。

[0688] 基于这些制剂,还可制备与其它农药活性化合物(例如杀虫剂、杀螨剂、除草剂、杀真菌剂)的结合物,以及与安全剂、肥料和/或生长调节剂的结合物,例如以最终制剂形式或者作为桶混物。

[0689] 可在本发明化合物的混合制剂或桶混物中使用的结合组分为例如基于对例如以下物质的抑制的已知活性成分:例如乙酰乳酸合酶、乙酰辅酶A羧化酶、纤维素合成酶、烯醇丙酮酰莽草酸-3-磷酸合酶、谷氨酰胺合成酶、对羟基苯基丙酮酸双加氧酶、八氢番茄红素去饱和酶、光合体系I、光合体系II、原卟啉原氧化酶,如 Weed Research 26(1986)441-445 或 “The Pesticide Manual”, 第15版, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2009 及其中引用的文献中所述。

可与本发明化合物相结合的已知除草剂或植物生长调节剂为例如以下活性成分（将所述化合物称作国际标准化组织（International Organization for Standardization, ISO）的通用名或化学名或代码），且总是包括其所有使用形式，例如酸、盐、酯和异构体（例如立体异构体和光学异构体）。例如，提及一种使用形式和——在一些情况下——数种使用形式：

[0690] 乙草胺 (acetochlor)、活化酯 (acibenzolar)、苯并噻二唑 (acibenzolar-S-methyl)、三氟羧草醚 (acifluorfen, acifluorfen-sodium)、苯草醚 (aclonifen)、甲草胺 (alachlor)、二丙烯草胺 (allidochlor)、禾草灭 (alloxydim, alloxydim-sodium)、莠灭净 (ametryn)、胺唑草酮 (amicarbazone)、先甲草胺 (amidochlor)、酰嘧磺隆 (amidosulfuron)、环丙嘧啶酸 (aminocyclopyrachlor)、氨草啶 (aminopyralid)、沙草强 (amitrole)、氨基磺酸铵 (ammonium sulfamate)、三环苯嘧啶醇 (ancymidol)、莎稗磷 (anilofos)、磺草灵 (asulam)、莠去津 (atrazine)、啶啉草酮 (azafenidin)、啶嘧磺隆 (azimsulfuron)、叠氮津 (aziprotryn)、氟丁酰草胺 (beflubutamid)、草除灵 (benazolin, benazolin-ethyl)、bencarbazone、乙丁氟灵 (benfluralin)、呋草黄 (benfuresate)、地散磷 (bensulide)、苄嘧磺隆 (bensulfuron, bensulfuron-methyl)、灭草松 (bentazone)、双苯嘧草酮 (benzfendizone)、双环磺草酮 (benzobicyclon)、吡草酮 (benzofenap)、氟磺胺草 (benzofluor)、新燕灵 (benzoylprop)、bicyclopyrone、甲羧除草醚 (bifenox)、双丙氨膦 (bilanafos, bilanafos-sodium)、双草醚 (bispyribac, bispyribac-sodium)、除草定 (bromacil)、溴丁酰草胺 (bromobutide)、溴酚肟 (bromofenoxim)、溴苯腈 (bromoxynil)、氯溴隆 (bromuron)、特克草 (buminafos)、羧草酮 (busoxinone)、丁草胺 (butachlor)、氟丙嘧草酯 (butafenacil)、抑草磷 (butamifos)、丁烯草胺 (butenachlor)、仲丁灵 (butralin)、丁氧环酮 (butroxydim)、丁草敌 (butylate)、啶草胺 (cafenstrole)、双酰草胺 (carbetamide)、氟啶草酮 (carfentrazone, carfentrazone-ethyl)、甲氧除草醚 (chlomethoxyfen)、草灭畏 (chloramben)、炔禾灵 (chlorazifop, chlorazifop-butyl)、氯溴隆 (chlorbromuron)、氯炔灵 (chlorbufam)、伐草克 (chlorfenac, chlorfenac-sodium)、燕麦酯 (chlorfenprop)、甲基氯苄素 (chlorflurenol, chlorflurenol-methyl)、氯草敏 (chloridazon)、氯嘧磺隆 (chlorimuron, chlorimuron-ethyl)、矮壮素 (chlormequat chloride)、草枯醚 (chlornitrofen)、chlorophthalim、氯酞酸甲酯 (chlorthal-dimethyl)、绿麦隆 (chlorotoluron)、氯磺隆 (chlorsulfuron)、吡啶酮草酯 (cinidon, cinidon-ethyl)、环庚草醚 (cinmethylin)、醚磺隆 (cinosulfuron)、烯草酮 (clethodim)、炔草酸 (clodinafop)、炔草酯 (clodinafop-propargyl)、杀雄嗪酸 (clofencet)、异噁草松 (clomazone)、氯甲酰草胺 (clomeprop)、调果酸 (cloprop)、二氯吡啶酸 (clopymid) 、氯酯磺草酸 (cloransulam, cloransulam-methyl)、苄草隆 (cumyluron)、氨基氰 (cyanamide)、氰草津 (cyanazine)、环丙酰胺酸 (cyclanilide)、环草敌 (cycloate)、环丙嘧磺隆 (cyclosulfamuron)、噻草酮 (cycloxydim)、环莠隆 (cycluron)、氰氟草酯 (cyhalofop, cyhalofop-butyl)、莎草快 (cyperquat)、环丙津 (cyprazine)、环唑塞胺 (cyprazole)、2, 4-D、2, 4-DB、杀草隆 (daimuron/dymron)、茅草枯 (dalapon)、丁酰肼 (daminozide)、棉隆 (dazomet)、正癸醇、甜菜安 (desmedipham)、敌草净 (desmetryn)、detosyl

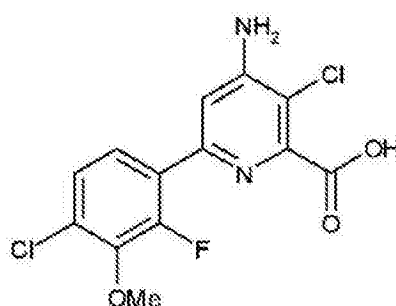
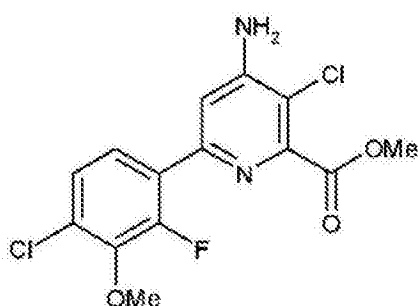
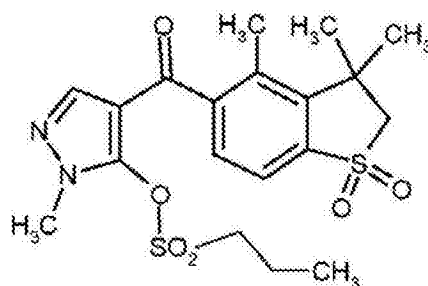
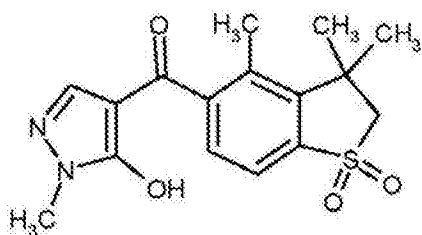
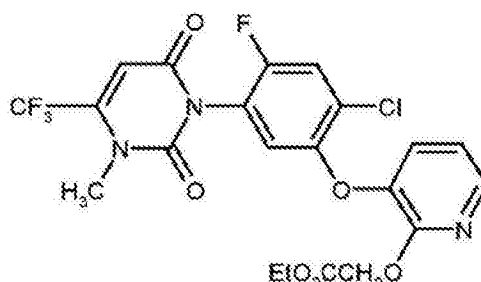
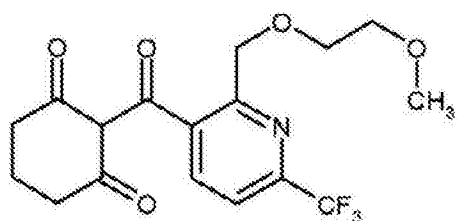
pyrazolate(DTP)、燕麦敌 (diallate)、麦草畏 (dicamba)、敌草腈 (dichlobenil)、2,4- 滴丙酸 (dichlorprop)、精 2,4- 滴丙酸 (dichlorprop-P)、氯 甲 草 (diclofop)、禾 草 灵 (diclofop-methyl)、diclofop-P-methyl、双 氯 磺 草 胺 (diclosulam)、乙 酰 甲 草 胺 (diethatyl, diethatyl-ethyl)、枯 莠 隆 (difenoxuron)、野 燕 枯 (difenzoquat)、吡 氟 酰 草 胺 (diflufenican)、二 氟 吡 隆 (diflufenzopyr, diflufenzopyr-sodium)、噁 唑 隆 (dimefuron)、调 味 酸 (dikegulac-sodium)、噁 唑 隆 (dimefuron)、哌 草 丹 (dimepiperate)、二甲草胺 (dimethachlor)、异戊乙净 (dimethametryn)、二甲吩草胺 (dimethenamid)、精二甲吩草胺 (dimethenamid-P)、噻 节 因 (dimethipin)、dimetrasulfuron、氨 氟 灵 (dinitramine)、地 乐 酚 (dinoseb)、特 乐 酚 (dinoterb)、双 苯 酰 草 胺 (diphenamid)、异丙净 (dipropetryn)、敌 草 快 (diquat, diquat-dibromide)、氟 硫 草 定 (dithiopyr)、敌 草 隆 (diuron)、DNOC、草 止 津 (eglinazine-ethyl)、茵 多 酸 (endothal)、EPTC、戊 草 丹 (esprocarb)、乙 丁 烯 氟 灵 (ethalfluralin)、胺 苯 磺 隆 (ethametsulfuron、ethametsulfuron-methyl)、乙 烯 利 (ethephon)、磺 噻 隆 (ethidimuron)、乙 噻 草 酮 (ethiozin)、乙 氧 呋 草 黄 (ethofumesate)、氟 乳 醚 (ethoxyfen)、氟 乳 醚 乙 酯 (ethoxyfen-ethyl)、乙 氧 嘧 磺 隆 (ethoxysulfuron)、乙 氧 苯 草 胺 (etobenzanid)、F-5331 即 N-[2- 氯 -4- 氟 -5-[4-(3- 氟 丙 基)-4,5- 二 氢 -5- 氧 -1H- 四 唑 -1- 基] 苯 基] 乙 磺 酰 胺、F-7967 即 3-[7- 氯 -5- 氟 -2-(三 氟 甲 基)-1H- 苯 并 咪 唑 -4- 基]-1- 甲 基 -6-(三 氟 甲 基) 嘧 啶 -2,4-(1H,3H)- 二 酮、2,4,5- 涕 丙 酸 (fenoprop)、噁 唑 禾 草 灵 (fenoxaprop)、高 噁 唑 禾 草 灵 (fenoxaprop-P)、噁 唑 禾 草 灵 (fenoxaprop-ethyl)、高 噁 唑 禾 草 灵 (fenoxaprop-P-ethyl)、fenoxasulfone、四 唑 酰 草 胺 (fentrazamide)、非 草 隆 (fenuron)、氟 燕 灵 (flamprop)、强 氟 燕 灵 (flamprop-M-isopropyl)、甲 氟 燕 灵 (flamprop-M-methyl)、啉 嘧 磺 隆 (flazasulfuron)、双 氟 磺 草 胺 (florasulam)、吡 氟 禾 草 灵 (fluazifop)、精 吡 氟 禾 草 灵 (fluazifop-P)、吡 氟 禾 草 灵 丁 酯 (fluazifop-butyl)、精 吡 氟 禾 草 灵 丁 酯 (fluazifop-P-butyl)、异 丙 吡 草 酯 (fluazolate)、氟 酮 磺 隆 (flucarbazone, flucarbazone-sodium)、氟 吡 磺 隆 (flucetosulfuron)、氯 乙 氟 灵 (fluchloralin)、氟 噻 草 胺 (flufenacet(thiaflumide))、氟 哒 嗪 草 酯 (flufenpyr, flufenpyr-ethyl)、氟 节 胺 (flumetralin)、唑 嘧 磺 草 胺 (flumetsulam)、氟 烯 草 酸 (flumiclorac, flumiclorac-pentyl)、丙 炔 氟 草 胺 (flumioxazin)、炔 草 胺 (flumipropyn)、氟 草 隆 (fluometuron)、三 氟 硝 草 醚 (fluorodifen)、乙 羧 氟 草 醚 (fluoroglycofen, fluoroglycofen-ethyl)、氟 胺 草 唑 (flupoxam)、flupropacil、四 氟 丙 酸 (flupropanate)、氟 啉 嘧 磺 隆 (flupyrsulfuron, flupyrsulfuron-methyl-sodium)、9- 羟 基 苄 甲 酸 (flurenol)、苄 丁 酯 (flurenol-butyl)、氟 啉 草 酮 (fluridone)、氟 咯 草 酮 (flurochloridone)、氯 氟 吡 氧 乙 酸 (fluroxypyr, fluroxypyr-meptyl)、呋 嘧 醇 (flurprimidol)、呋 草 酮 (flurtamone)、噻 草 酸 (fluthiacet)、噻 草 酸 甲 酯 (fluthiacet-methyl)、噻 唑 草 酰 胺 (fluthiamide)、氟 磺 胺 草 醚 (fomesafen)、甲 酰 氨 磺 隆 (foramsulfuron)、氯 吡 脲 (forchlorfenuron)、杀 木 膦 (fosamine)、呋 氧 草 醚 (furyloxyfen)、赤 霉 素 (gibberellic acid)、草 铵 膦 (glufosinate, glufosinate-ammonium)、精 草 铵 膦 (glufosinate-P, glufosinate-P-ammonium)、精 草 铵 膦 钠 盐 (glufosinate-P-sodium)、草 甘 膦、草 甘 膦 异 丙 胺 盐

(glyphosate-isopropylammonium)、H-9201 即 0-(2,4-二甲基-6-硝基苯基)O-乙基异丙基硫代磷酰胺酯、氟硝磺酰胺(halosafen)、氯吡嘧磺隆(halosulfuron, halosulfuron-methyl)、氟吡禾灵(haloxypfop)、精氟吡禾灵(haloxypfop-P)、氟吡禾灵乙氧基乙酯(haloxypfop-ethoxyethyl)、吡氟氯禾灵乙氧基乙酯(haloxypfop-P-ethoxyethyl)、氟吡禾灵甲酯(haloxypfop-methyl)、吡氟氯禾灵甲酯(haloxypfop-P-methyl)、环嗪酮(hexazinone)、HW-02 即 1-(二甲氧基磷酰基)乙基-(2,4-二氯苯氧基)乙酸酯、咪草酸(imazamethabenz, imazamethabenz-methyl)、甲氧咪草烟(imazamox, imazamox-ammonium)、甲咪唑烟酸(imazapic)、咪唑烟酸(imazapyr)、咪唑烟酸异丙铵盐(imazapyr-isopropylammonium)、咪唑喹啉酸(imazaquin)、咪唑喹啉酸(imazaquin-ammonium)、咪唑乙烟酸(imazethapyr, imazethapyr-ammonium)、唑吡嘧磺隆(imazosulfuron)、抗倒胺(inabenzfide)、茚草酮(indanofan)、indaziflam、吲哚乙酸(IAA)、4-吲哚-3-基丁酸(IBA)、碘甲磺隆(iodosulfuron, iodosulfuron-methyl-sodium)、碘苯腈(ioxynil)、ipfencarbazone、丁腈酰胺(isocarbamid)、异丙乐灵(isopropalin)、异丙隆(isoproturon)、异噁隆(isouron)、异噁酰草胺(isoxaben)、异噁氯草酮(isoxachlortole)、异噁唑草酮(isoxaflutole)、异噁草醚(isoxapyrifop)、KU-043 即 3-[5-(二氟甲基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-基]甲基}磺酰基)-5,5-二甲基-4,5-二氢-1,2-噁唑、特胺灵(karbutilate)、ketospiradox、乳氟禾草灵(lactofen)、环草定(lenacil)、利谷隆(linuron)、马来酰肼(maleic hydrazide)、MCPA、MCPB、MCPB 甲酯、MCPB 乙酯、MCPB 钠、2-甲-4-氯丙酸(mecoprop)、2-甲-4-氯丙酸钠、mecoprop-butotyl、mecoprop-P-butotyl、精-2-甲-4-氯丙酸二甲基铵(mecoprop-P-dimethylammonium)、精-2-甲-4-氯丙酸-2-乙基己酯(mecoprop-P-2-ethylhexyl)、精-2-甲-4-氯丙酸钾(mecoprop-P-potassium)、苯噻酰草胺(mefenacet)、氯磺酰草胺(mefluidide)、甲哌啶(mepiquat chloride)、甲磺胺磺隆(mesosulfuron, mesosulfuron-methyl)、甲基磺草酮(mesotrione)、甲基苯噻隆(methabenzthiazuron)、威百亩(metam)、噁唑酰草胺(metamifop)、苯噻草酮(metamitron)、吡唑草胺(metazachlor)、metazasulfuron、灭草唑(methazole)、methiopyrsulfuron、methiozolin、苯草酮(methoxyphenone)、甲基杀草隆(methyldymron)、1-甲基环丙烯、硫代异氰酸甲酯、吡喃隆(metobenzuron)、溴谷隆(metobromuron)、异丙甲草胺(metolachlor)、精异丙甲草胺(S-metolachlor)、磺草唑胺(metosulam)、甲氧隆(metoxuron)、噻草酮(metribuzin)、甲磺隆(metsulfuron, metsulfuron-methyl)、禾草敌(molinate)、庚酰草胺(monalide)、monocarbamide、甲酰胺硫酸盐(monocarbamide dihydrogensulfate)、绿谷隆(monolinuron)、单嘧磺隆(monosulfuron, monosulfuron ester)、灭草隆(monuron)、MT-128 即 6-氯-N-[(2E)-3-氯丙-2-烯-1-基]-5-甲基-N-苯基吡嗪-3-胺、MT-5950 即 N-[3-氯-4-(1-甲基乙基)-苯基]-2-甲基戊酰胺、NGGC-011、萘丙胺(naproanilide)、敌草胺(napropamide)、萘草胺(naptalam)、NC-310 即 4-(2,4-二氯苯甲酰基)-1-甲基-5-苄基氧基吡唑、草不隆(neburon)、烟嘧磺隆(nicosulfuron)、氟氯草胺(nipyraclofen)、甲磺乐灵(nitralin)、除草醚(nitrofen)、硝基苯酚钠(异构体混合物)、硝氟草醚(nitrofluorfen)、壬酸、氟草敏(norflurazon)、坪草丹(orbencarb)、嘧苯胺磺隆(orthosulfamuron)、氨磺乐灵

(oryzalin)、丙炔噁草酮 (oxadiargyl)、噁草酮 (oxadiazon)、环氧嘧磺隆 (oxasulfuron)、噁嗪草酮 (oxaziclomefone)、乙氧氟草醚 (oxyfluorfen)、多效唑 (paclobutrazol)、百草枯 (paraquat, paraquat dichloride)、壬酸、二甲戊灵 (pendimethalin)、pendralin、五氟磺草胺 (penoxsulam)、甲氯酰草胺 (pentanochlor)、环戊噁草酮 (pentoxazone)、黄草伏 (perfluidone)、烯草胺 (pethoxamid)、棉胺宁 (phenisopham)、甜菜宁 (phenmedipham, phenmedipham-ethyl)、氨基吡啶酸 (picloram)、氟吡酰草胺 (picolinafen)、唑啉草酯 (pinoxaden)、哌草磷 (piperophos)、pirifenop、pirifenop-butyl、丙草胺 (pretilachlor)、氟嘧磺隆 (primisulfuron, primisulfuron-methyl)、烯丙苯噁唑 (probenazole)、氟唑草胺 (profluazol)、环丙氰津 (procyazine)、氨氟乐灵 (prodiamine)、环丙氟灵 (prifluraline)、环苯草酮 (profoxydim)、调环酸 (prohexadione)、调环酸钙 (prohexadione-calcium)、茉莉酮 (prohydrojasnone)、扑灭通 (prometon)、扑草净 (prometryn)、毒草胺 (propachlor)、敌稗 (propanil)、噁草酸 (propaquizafop)、扑灭津 (propazine)、苯胺灵 (propham)、异丙草胺 (propisochlor)、丙苯磺隆 (propoxycarbazone, propoxycarbazone-sodium)、propyrisulfuron、炔苯酰草胺 (propyzamide)、磺亚胺草 (prosulfalin)、苄草丹 (prosulfocarb)、氟磺隆 (prosulfuron)、丙炔草胺 (prynachlor)、双唑草腈 (pyraclonil)、吡草醚 (pyraflufen, pyraflufen-ethyl)、pyrasulfotole、吡唑特 (pyrazolynate (pyrazolate))、吡嘧磺隆 (pyrazosulfuron, pyrazosulfuron-ethyl)、苄草唑 (pyrazoxyfen)、pyribambenz、异丙酯草醚 (pyribambenz-isopropyl)、丙酯草醚 (pyribambenz-propyl)、嘧啶𬝓草醚 (pyribenzoxim)、稗草丹 (pyributicarb)、pyridafol、吡草特 (pyridate)、环酯草醚 (pyriftalid)、嘧草醚 (pyriminobac, pyriminobac-methyl)、pyrimisulfan、嘧草硫醚 (pyrithiobac, pyrithiobac-sodium)、pyroxasulfone、甲氧磺草胺 (pyroxsulam)、二氯喹啉酸 (quinclorac)、氯甲喹啉酸 (quinmerac)、灭藻醌 (quinoclamine)、喹禾灵 (quizalofop)、喹禾灵乙酯 (quizalofop-ethyl)、精喹禾灵 (quizalofop-P)、精喹禾灵乙酯 (quizalofop-P-ethyl)、喹禾糠酯 (quizalofop-P-tefuryl)、砒嘧磺隆 (rimsulfuron)、苯嘧磺草胺 (saflufenacil)、仲丁通 (secbumeton)、烯禾啉 (sethoxydim)、环草隆 (siduron)、西玛津 (simazine)、西草净 (simetryn)、SN-106279 即 (2R)-2-({7-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]-2-萘基}氧基)丙酸甲酯、磺草酮 (sulcotrione)、菜草畏 (sulfallate (CDEC))、甲磺草胺 (sulfentrazone)、甲嘧磺隆 (sulfometuron, sulfometuron-methyl)、草硫膦 (sulfosate (glyphosate-trimesium))、磺酰磺隆 (sulfosulfuron)、SYN-523、SYP-249 即 1-乙氧基-3-甲基-1-氧代丁-3-烯-2-基-5-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]-2-硝基苯甲酸酯、SYP-300 即 1-[7-氟-3-氧代-4-(丙-2-炔-1-基)-3,4-二氢-2H-1,4-苯并噁嗪-6-基]-3-丙基-2-硫代咪唑烷基-4,5-二酮、牧草胺 (tebutam)、丁噁隆 (tebuthiuron)、四氧硝基苯 (tecnazene)、tefuryltrione、tembotrione、吡喃草酮 (tepraloxymid)、特草定 (terbacil)、特草灵 (terbucarb)、特丁草胺 (terbuchlor)、特丁通 (terbumeton)、特丁津 (terbuthylazine)、特丁净 (terbutryn)、噁吩草胺 (thenylchlor)、thiaflumide、噁氟隆 (thiazafluron)、噁唑烟酸 (thiazopyr)、噁二唑草胺 (thidiazimin)、噁苯隆 (thidiazuron)、thiencarbazone、thiencarbazone-methyl、噁吩磺隆 (thifensulfuron,

thifensulfuron-methyl)、禾草丹 (thiobencarb)、仲草丹 (tiocarbazil)、topramezone、三甲苯草酮 (tralkoxydim)、野燕畏 (triallate)、醚苯磺隆 (triasulfuron)、三嗪氟草胺 (triaziflam)、triazofenamide、苯磺隆 (tribenuron, tribenuron-methyl)、三氯乙酸 (TCA)、三氯吡氧乙酸 (triclopyr)、灭草环 (tridiphane)、草达津 (trietazine)、三氟啶磺隆 (trifloxysulfuron, trifloxysulfuron-sodium)、氟乐灵 (trifluralin)、氟胺磺隆 (triflusulfuron)、氟胺磺隆甲酯 (triflusulfuron-methyl)、三甲隆 (trimeturon)、抗倒酯 (trinexapac, trinexapac-ethyl)、三氟甲磺隆 (tritosulfuron)、tsitodef、烯效唑 (uniconazole)、精烯效唑 (uniconazole-P)、灭草敌 (vernolate)、ZJ-0862 即 3,4-二氯-N-[[4,6-二甲氧基嘧啶-2-基)氧基]苄基]苯胺和以下化合物:

[0691]



[0692] 为了应用,将市售形式的制剂任选以常规方式稀释,例如在可湿性粉剂、乳油、分散剂和水分散性颗粒剂的情况下,用水稀释。粉末剂、用于土壤施用的颗粒剂或者用于撒播的颗粒剂以及可喷雾溶液剂,在施用前通常不用任何其它惰性物质稀释。

[0693] 式(I)化合物的所需施用率根据外部条件(例如,在所述因素中,温度、湿度和所用除草剂类型)而变化。其可在很宽的范围内变化,例如在0.001至1.0kg/ha或更多活性物质之间;然而,优选地在0.005至750g/ha之间。

[0694] 以下实施例用于详细说明本发明。

[0695] A. 化学实施例

[0696] 1. 4-烯丙基-7-羟基-6-(2,4,6-三甲苯基)[1,3]噻唑[4,5-b]吡啶-5(4H)-酮

(化合物 I-a-2) 的制备:

[0697] 首先将 1.8g(5mmol)4-[烯丙基(2,4,6-三甲苯基乙酰基)氨基]-1,3-噻唑-5-羧酸甲酯置于 5ml N,N-二甲基甲酰胺中并且冷却至 0℃,加入 1.5 当量氢化钠(60%)并且逐渐升至室温(RT)。在室温搅拌 1 小时后,加入 5ml 水并且将混合物酸化至 pH1-2。抽滤所形成的沉淀。从而获得 1.5g 本发明的化合物 I-a-2。

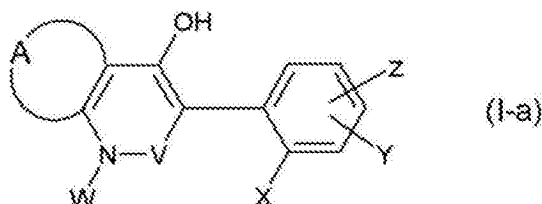
[0698] 2.1-(2,2-二氟乙基)-3-(2-碘苯基)-1H-[1,3]噻唑并[4,5-c][1,2]噻嗪-4-醇 2,2-二氧化物(化合物 I-a-14)的制备

[0699] 将 2.0g(4mmol)4-{2,2-二氟乙基}[(2-碘苄基)磺酰基]氨基}-1,3-噻唑-5-羧酸甲酯溶于 25ml 二甲基甲酰胺中并且冷却至室温,加入 143.3mg(6mmol)氢化钠。加入后,将混合物升至室温并且搅拌 12 小时。随后,将反应混合物倾入 100ml 水中并且用 2N HCl 调 pH 至 4-5。将所形成的沉淀过滤并且用水洗。这样得到 1.7g 化合物 I-a-14。

[0700] 类似于化合物 I-a-2 和 I-a-14 的制备并且根据所述制备的一般细节,获得以下式(I-a)的化合物:

[0701] 表 229:本发明的式(I)化合物,其中 G 为氢:

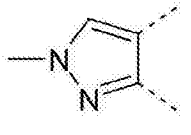
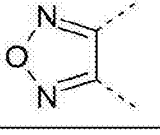
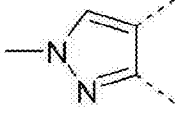
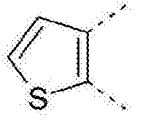
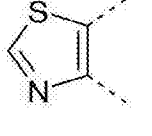
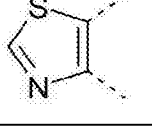
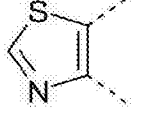
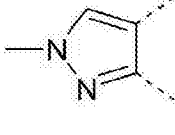
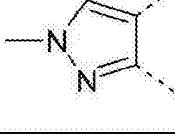
[0702]



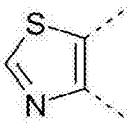
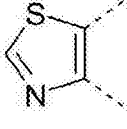
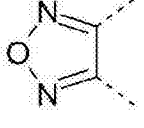
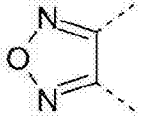
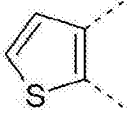
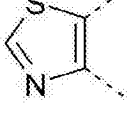
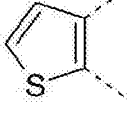
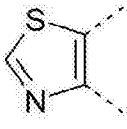
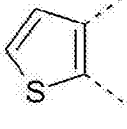
[0703]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-1		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 9.06 (s, 1H); 7.57 (d, 1H); 7.39 (d, 1H); 7.36 (dd, 1H); 6.14 (tt, 1H); 6.00 (s, 1H); 4.53 (m, 2H)
I-a-2		C=O	CH ₂ -CH=CH 2	Me	4-Me	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.6 (bs, 1H), 9.31 (s, 1H), 6.90 (s, 2H), 5.96 (m, 1H), 5.07 (m, 1H), 4.90 (m, 3H), 2.27 (s, 3H), 1.97 (s, 6H)
I-a-3		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.48 (m, 2H); 7.38 (dd, 1H); 7.19 (s, 1H); 6.12 (tt, 1H); 3.94 (m, 2H)
I-a-4		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.34 (bs, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 6.32 (m, 1H), 4.67 (m, 2H), 2.81 (s, 3H), 2.38 (m, 2H)

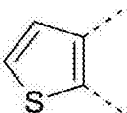
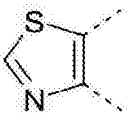
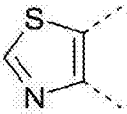
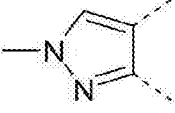
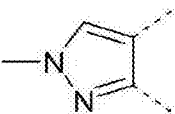
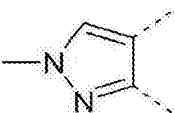
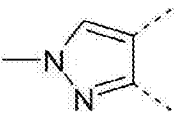
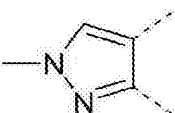
[0704]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
							1.00 (t, 3H)
I-a-5		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	H	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.95 (s, 1H); 7.80 (d, 1H); 7.60 (m, 2H); 7.26 (s, 1H); 6.16 (tt, 1H); 5.61 (s, 1H); 4.27 (m, 2H); 3.93 (s, 3H)
I-a-6		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	H	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.84 (d, 1H); 7.66 (m, 3H); 7.24 (s, 1H); 6.11 (tt, 1H); 3.93 (m, 2H)
I-a-7		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.96 (s, 1H); 7.55 (d, 1H); 7.33 (m, 2H); 6.15 (tt, 1H); 5.84 (s, 1H); 4.25 (m, 2H); 3.93 (s, 3H)
I-a-8		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.8 (bs, 1H); 7.53 (m, 3H); 7.38 (t, 1H); 7.28 (d, 1H); 3.53 (s, 3H)
I-a-9		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 9.05 (s, 1H); 7.50 (d, 1H); 7.43 (d, 1H); 7.37 (t, 1H); 6.24 (s, 1H); 6.20 (tt, 1H); 4.49 (m, 2H)
I-a-10		SO ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 9.07 (s, 1H); 7.83 (d, 1H); 7.65 (m, 3H); 5.79 (s, 1H); 4.83 (m, 2H)
I-a-11		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	H	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 9.06 (s, 1H); 7.83 (d, 1H); 7.64 (m, 3H); 6.15 (tt, 1H); 5.75 (s, 1H); 4.52 (m, 2H)
I-a-12		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	I	H	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.97 (m, 2H); 7.39 (m, 2H); 7.14 (m, 1H); 6.15 (tt, 1H); 5.88 (s, 1H); 4.25 (m, 2H); 3.92 (s, 3H)
I-a-13		SO ₂	CH ₂ CF ₃	I	H	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.98 (m, 2H); 7.39 (m, 2H); 7.13 (m, 1H); 5.92 (s, 1H); 4.54 (q, 2H); 3.94 (s, 3H)

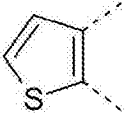
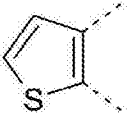
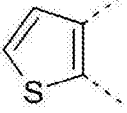
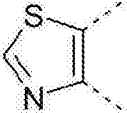
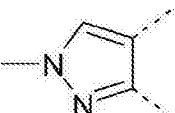
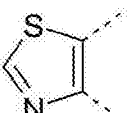
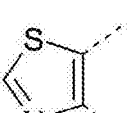
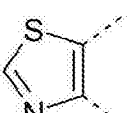
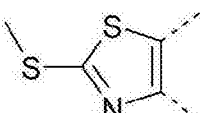
[0705]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-14		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	I	H	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 9.06 (s, 1H); 7.99 (d, 1H); 7.42 (m, 2H); 7.18 (m, 1H); 6.14 (tt, 1H); 6.04 (s, 1H); 4.53 (m, 2H)
I-a-15		SO ₂	CH ₂ CF ₃	I	H	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 9.06 (s, 1H); 7.99 (d, 1H); 7.43 (m, 2H); 7.18 (m, 1H); 6.09 (s, 1H); 4.82 (m, 2H)
I-a-16		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.48 (m, 2H), 7.38 (t, 1H), 3.58 (s, 3H)
I-a-17		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 12.00 (s, 1H); 7.80 (d, 1H); 7.55 (dd, 1H); 7.51 (d, 1H); 6.25 (tt, 1H); 3.88 (m, 2H)
I-a-18		C=O	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.48 (m, 2H), 7.34 (m, 2H), 6.98 (d, 1H), 5.93 (m, 1H), 5.27 (m, 2H), 4.78 (m, 2H)
I-a-19		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): 11.3 (bs, 1H), 9.42 (s, 1H), 7.53 (m, 2H), 7.38 (t, 1H), 3.72 (s, 3H)
I-a-20		C=O	CH ₂ -CH=CH ₂	Me	4-Me	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): 10.1 (bs, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 6.88 (s, 2H), 5.89 (m, 1H), 5.19 (m, 1H), 5.05 (m, 1H), 4.68 (m, 2H), 2.26 (s, 3H), 1.96 (s, 6H)
I-a-21		C=O	CH ₂ CF ₃	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): 11.7 (bs, 1H), 9.38 (s, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 5.12 (m, 2H), 2.39 (m, 2H), 1.02 (dt, 3H)
I-a-22		C=O	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	4-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): 10.7 (bs, 1H), 7.65 (m, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.42 (m, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.28 (d, 1H), 5.87 (m, 1H), 5.19 (m, 2H), 4.68 (m, 2H)

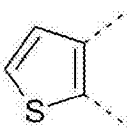
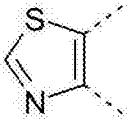
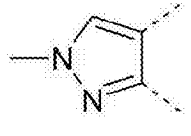
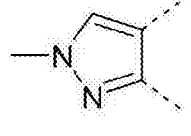
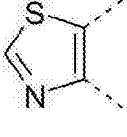
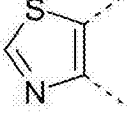
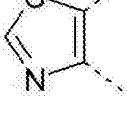
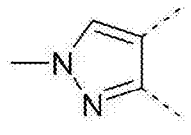
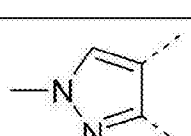
[0706]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-23		C=O	$\text{CH}_2\text{-CH=CH}$ 2	Br	4-Cl	6-Et	^1H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.6 (bs, 1H), 7.62 (m, 1H), 7.47 (m, 1H), 7.38 (m, 1H), 7.27 (d, 1H), 5.87 (m, 1H), 5.19 (m, 1H), 5.05 (m, 1H), 4.68 (m, 2H), 2.39 (m, 2H), 1.01 (t, 3H)
I-a-24		C=O	$\text{CH}_2\text{-CH=CH}$ 2	Br	4-Cl	6-Et	^1H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.2 (bs, 1H), 9.36 (s, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 5.95 (m, 1H), 5.08 (m, 1H), 4.94 (m, 3H), 2.38 (q, 2H), 1.01 (t, 3H)
I-a-25		C=O	$\text{CH}_2\text{-CH=CH}$ 2	Cl	6-Cl	H	^1H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 9.38 (s, 1H), 7.52 (m, 2H), 7.40 (m, 1H), 5.95 (m, 1H), 5.09 (m, 1H), 4.95 (m, 3H)
I-a-26		SO ₂	CH_2CHF_2	Cl	6-Cl	H	^1H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.99 (s, 1H); 7.48 (dd, 1H); 7.40 (dd, 1H); 7.33 (t, 1H); 6.22 (tt, 1H); 6.09 (s, 1H); 4.25 (m, 2H); 3.92 (s, 3H)
I-a-27		C=O	$\text{CH}_2\text{-CH=CH}$ 2	Cl	4-Cl	H	^1H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 8.18 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.38 (dd, 1H), 7.27 (d, 2H), 5.89 (m, 1H), 5.07 (m, 2H), 4.58 (m, 2H), 3.94 (s, 3H)
I-a-28		C=O	$\text{CH}_2\text{-CH=CH}$ 2	Br	4-Cl	Et	^1H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 8.17 (s, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 5.89 (m, 1H), 5.05 (m, 1H), 4.95 (m, 1H), 4.58 (m, 2H), 3.94 (s, 3H), 2.38 (m, 2H), 0.99 (t, 3H)
I-a-29		C=O	$\text{CH}_2\text{-CH=CH}$ 2	Me	4-Me	6-Me	^1H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.4 (bs, 1H), 8.13 (s, 1H), 6.84 (d, 2H), 5.89 (m, 1H), 5.05 (m, 1H), 4.94 (m, 1H), 4.60 (m, 2H), 3.93 (s, 3H)
I-a-30		C=O	$\text{CH}_2\text{-CH=CH}$ 2	Cl	6-Cl	H	^1H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.1 (bs, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.48 (dd, 2H), 7.34 (dd, 1H), 5.90 (m, 1H), 5.07 (m, 1H), 4.99 (m, 1H), 4.59 (m, 2H), 3.95 (s, 3H)

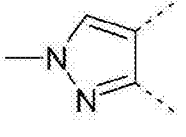
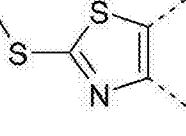
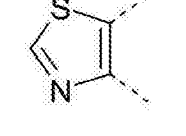
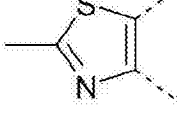
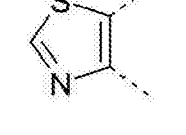
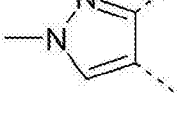
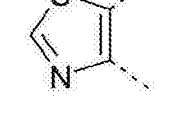
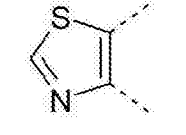
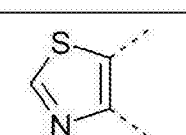
[0707]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-31		C=O	CH=CH-OC H ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.44 (m, 2H), 7.28 (m, 2H), 6.93 (d, 1H), 6.27 (d, 1H), 5.84 (d, 1H), 3.71 (s, 3H)
I-a-32		C=O	CH=CH-F (Z 异构体)	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.85 (dd, 1H), 7.47 (m, 2H), 7.33 (m, 2H), 6.93 (d, 1H), 6.27 (d, 1H)
I-a-33		C=O	CH=CH-F (E 异构体)	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.42 (m, 2H), 7.32 (m, 2H), 6.95 (d, 1H), 6.80 (dd, 1H), 6.32 (dd, 1H),
I-a-34		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.5 (bs, 1H), 9.41 (s, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.33 (d, 1H), 6.34 (m, 1H), 4.72 (m, 2H)
I-a-35		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.49 (dd, 2H), 7.36 (dd, 1H), 6.31 (m, 1H), 4.42 (m, 2H), 3.97 (s, 3H)
I-a-36		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.5 (bs, 1H), 9.41 (s, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 6.33 (m, 1H), 4.75 (m, 2H), 2.39 (m, 2H), 1.03 (t, 3H)
I-a-37		C=O	CH ₂ CHF ₂	Me	4-Me	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.8 (bs, 1H), 9.36 (s, 1H), 6.90 (s, 2H), 6.35 (m, 1H), 4.75 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.97 (s, 6H)
I-a-38		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.7 (bs, 1H), 9.42 (s, 1H), 7.53 (d, 2H), 7.41 (t, 1H), 6.34 (m, 1H), 4.75 (m, 2H)
I-a-39		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.8 (bs, 1H), 7.51 (d, 2H), 7.41 (t, 1H), 6.33 (m, 1H), 4.67 (m, 2H), 2.81 (s, 3H)

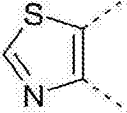
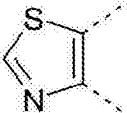
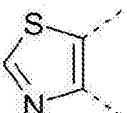
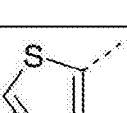
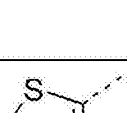
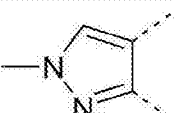
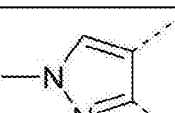
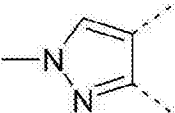
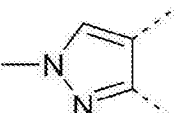
[0708]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-40		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.49 (d, 2H), 7.33 (m, 2H), 7.00 (d, 1H), 6.23 (m, 1H), 4.44 (m, 2H)
I-a-41		C=O	CH ₂ CF ₃	Me	4-Me	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.0 (bs, 1H), 9.37 (s, 1H), 6.91 (s, 2H), 5.13 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.98 (s, 6H)
I-a-42		C=O	CH ₂ CHF ₂	Me	4-Me	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.7 (bs, 1H), 8.18 (s, 1H), 6.85 (s, 2H), 6.31 (m, 1H), 4.41 (m, 2H), 3.95 (s, 3H)
I-a-43		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.1 (bs, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 6.30 (m, 1H), 4.42 (m, 2H), 3.97 (s, 3H)
I-a-44		C=O	CH ₂ C≡CH	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.6 (bs, 1H), 9.42 (s, 1H), 7.50 (d, 2H), 7.40 (t, 1H), 5.04 (d, 2H), 3.15 (t, 1H)
I-a-45		C=O	CH ₂ CF ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.8 (bs, 1H), 9.43 (s, 1H), 7.54 (d, 2H), 7.42 (t, 1H), 5.13 (m, 2H)
I-a-46		C=O	CH ₂ C≡CH	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.7 (bs, 1H), 9.42 (s, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 5.04 (d, 2H), 3.13 (t, 1H), 2.39 (m, 2H), 1.01 (dt, 3H)
I-a-47		C=O	CH ₂ CF ₃	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.2 (bs, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 4.80 (m, 2H), 3.96 (s, 3H), 2.38 (m, 2H), 0.99 (t, 3H)
I-a-48		C=O	CH ₂ CF ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.49 (d, 2H), 7.36 (t, 1H), 4.80 (m, 2H), 3.97 (s, 3H)

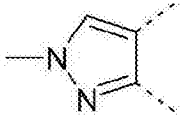
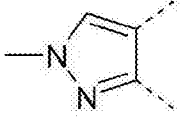
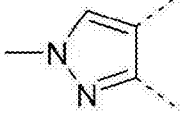
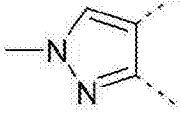
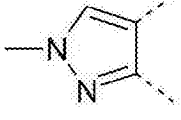
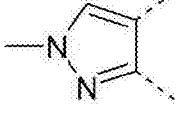
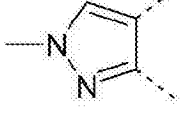
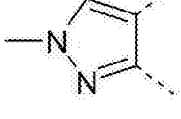
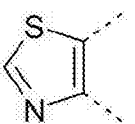
[0709]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-49		C=O	CH ₂ CF ₃	Me	4-Me	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.7 (bs, 1H), 8.16 (s, 1H), 6.86 (d, 2H), 4.80 (m, 2H), 3.95 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.95 (s, 6H)
I-a-50		C=O	CH ₂ C≡CH	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.5 (bs, 1H), 7.51 (d, 2H), 7.39 (t, 1H), 4.97 (d, 2H), 3.16 (t, 1H), 2.85 (s, 3H)
I-a-51		C=O	CH ₂ CH ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 9.41 (s, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.40 (t, 1H), 4.35 (m, 2H), 1.24 (m, 3H)
I-a-52		C=O	CH ₂ C≡CH	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.5 (bs, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.40 (t, 1H), 4.98 (d, 2H), 3.14 (t, 1H), 2.83 (s, 3H)
I-a-53		C=O	CH ₂ -c-Pr	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-CDCl ₃): 8.91 (s, 1H), 7.41 (d, 2H), 7.23 (t, 1H), 4.35 (d, 2H), 1.43 (m, 1H), 0.47 (m, 4H)
I-a-54		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.6 (bs, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.49 (d, 2H), 7.36 (t, 1H), 6.25 (m, 1H), 4.35 (m, 2H), 4.05 (s, 3H)
I-a-55		C=O	CH ₂ C≡CH	Me	3-Br	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.1 (bs, 1H), 9.40 (s, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.06 (d, 1H), 5.04 (d, 2H), 3.12 (t, 1H), 2.22 (s, 3H), 1.98 (s, 3H)
I-a-56		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.6 (bs, 1H), 9.39 (s, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 6.33 (m, 1H), 4.74 (m, 2H), 2.39 (m, 2H), 1.03 (m, 3H)
I-a-57		C=O	CH ₂ CHF ₂	Me	3-Br	Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.2 (bs, 1H), 9.39 (s, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.06 (d, 1H), 6.35 (m, 1H), 4.74 (m, 2H), 2.10 (s, 3H), 1.98 (s, 3H)

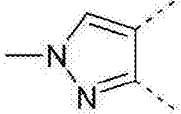
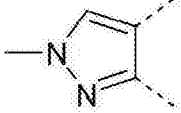
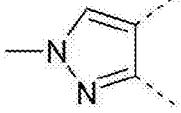
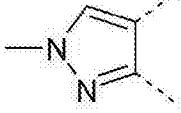
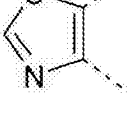
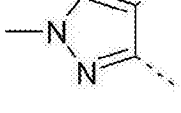
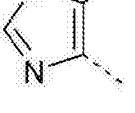
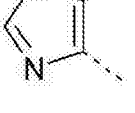
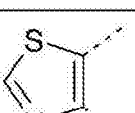
[0710]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-58		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.6 (bs, 1H), 9.40 (s, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 6.34 (m, 1H), 4.74 (m, 2H), 2.08 (s, 3H)
I-a-59		C=O	CH ₂ C≡CH	Cl	4-Cl	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 9.42 (s, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 5.04 (d, 2H), 3.14 (t, 1H), 2.08 (s, 3H)
I-a-60		C=O	CH ₂ CHF ₂	Et	4-Cl	6-OMe	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.9 (bs, 1H), 9.36 (s, 1H), 6.95 (d, 2H), 6.32 (m, 1H), 4.72 (m, 2H), 3.66 (s, 3H), 2.31 (m, 2H), 0.86 (m, 3H)
I-a-61		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Br	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 9.41 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 6.33 (m, 1H), 4.74 (m, 2H), 2.38 (m, 2H), 1.01 (m, 3H)
I-a-62		C=O	CH ₂ CHF ₂	Me	4-Cl	6-CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 9.40 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 6.31 (m, 1H), 4.73 (m, 2H), 2.08 (s, 3H)
I-a-63		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.75 (s, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.23 (d, 1H), 6.25 (m, 1H), 4.53 (m, 2H), 4.01 (s, 3H), 2.43 (m, 2H), 1.08 (m, 3H)
I-a-64		C=O	CH ₂ CF ₃	Cl	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.78 (s, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 4.82 (m, 2H), 3.98 (s, 3H), 2.40 (m, 2H), 1.06 (m, 3H)
I-a-65		C=O	CH ₂ CF ₃	Cl	4-Cl	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 4.80 (m, 2H), 3.97 (s, 3H), 2.06 (s, 3H)
I-a-66		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.2 (bs, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 6.32 (m, 1H), 4.43 (m, 2H), 3.97 (s, 3H), 2.06 (s, 3H)

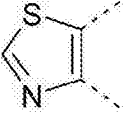
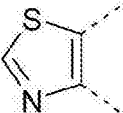
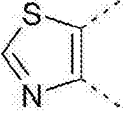
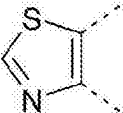
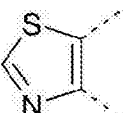
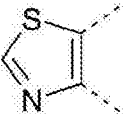
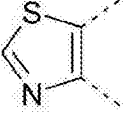
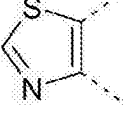
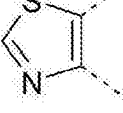
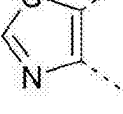
[0711]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-67		C=O	CH ₃	Cl	4-Cl	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.9 (bs, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 2.06 (s, 3H)
I-a-68		C=O	CH ₂ CF ₃	Cl	3-Br	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.6 (bs, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 4.80 (m, 2H), 3.97 (s, 3H)
I-a-69		C=O	CH ₃	Me	4-CF ₂ -CF ₃	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.8 (bs, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.37 (s, 2H), 3.97 (s, 3H), 3.42 (s, 3H), 2.09 (s, 6H)
I-a-70		C=O	CH ₃	Cl	3-Br	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.1 (bs, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.41 (s, 3H)
I-a-71		C=O	CH ₂ CF ₃	Me	4-CF ₂ -CF ₃	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.38 (s, 2H), 4.82 (m, 2H), 3.97 (s, 3H), 2.09 (s, 6H)
I-a-72		C=O	CH ₂ CHF ₂	Me	4-CF ₂ -CF ₃	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.1 (bs, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.37 (s, 2H), 6.33 (m, 1H), 4.42 (m, 2H), 3.98 (s, 3H), 2.09 (s, 6H)
I-a-73		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	3-Br	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 6.31 (m, 1H), 4.41 (m, 2H), 3.97 (s, 3H)
I-a-74		C=O	CH ₃	Cl	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.9 (bs, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.41 (s, 3H), 2.35 (m, 2H), 1.00 (m, 3H)
I-a-75		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	3-Br	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.8 (bs, 1H), 9.41 (s, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 6.33 (m, 1H), 4.72 (m, 2H)

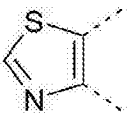
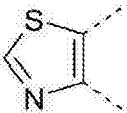
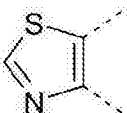
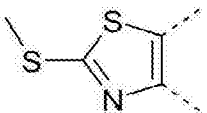
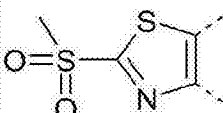
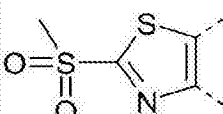
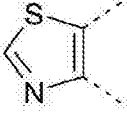
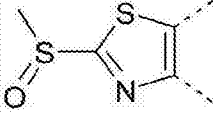
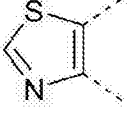
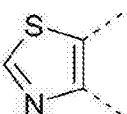
[0712]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-76		C=O	CH ₃	F	3-Me	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.1 (bs, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.25 (m, 2H), 3.97 (s, 3H), 3.40 (s, 3H), 2.22 (s, 3H)
I-a-77		C=O	CH ₂ CHF ₂	F	3-Me	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.5 (bs, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.24 (m, 2H), 6.33 (m, 1H), 4.39 (m, 2H), 3.97 (s, 3H), 2.22 (s, 3H)
I-a-78		C=O	CH ₂ CF ₃	F	3-Me	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 8.22 (s, 1H), 7.26 (m, 2H), 6.33 (m, 1H), 4.79 (m, 2H), 3.97 (s, 3H), 2.22 (s, 3H)
I-a-79		C=O	CH ₂ C≡CH	Me	4-CF ₂ -CF ₃	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.77 (s, 1H), 7.34 (s, 2H), 4.94 (d, 2H), 4.02 (s, 3H), 2.18 (t, 1H), 2.16 (s, 6H)
I-a-80		C=O	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	H	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 9.42 (s, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.69 (t, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.32 (d, 1H), 6.30 (m, 1H), 4.71 (m, 2H)
I-a-81		C=O	CH ₂ C≡CH	F	3-Me	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.2 (bs, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.25 (m, 2H), 4.73 (m, 2H), 3.99 (s, 3H), 3.10 (t, 1H), 2.22 (s, 3H)
I-a-82		C=O	CH ₃	I	H	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.0 (bs, 1H), 9.37 (s, 1H), 7.91 (d, 1H), 7.42 (t, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.09 (t, 1H), 3.69 (s, 3H)
I-a-83		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	3-c-P r	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.6 (bs, 1H), 9.38 (s, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 6.33 (m, 1H), 4.73 (m, 2H), 2.13 (m, 1H), 0.74 (m, 2H), 0.65 (m, 2H)
I-a-84		C=O	CH ₂ CHF ₂	I	H	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 9.40 (s, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.43 (t, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.10 (t, 1H), 6.33 (m, 1H), 4.74 (m, 2H),

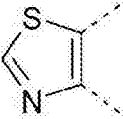
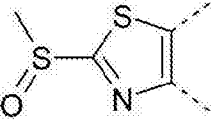
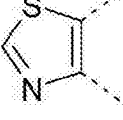
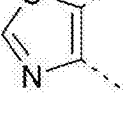
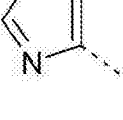
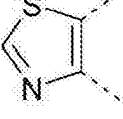
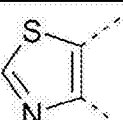
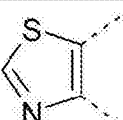
[0713]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-85		C=O	CH ₃	CF ₃	H	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.0 (bs, 1H), 9.37 (s, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.68 (t, 1H), 7.58 (t, 1H), 7.30 (d, 1H), 3.68 (s, 3H)
I-a-86		C=O	CH ₂ CF ₃	Cl	3-Me	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.7 (bs, 1H), 9.42 (s, 1H), 7.40 (m, 2H), 5.12 (m, 2H), 2.37 (s, 3H)
I-a-87		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Br	6-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.8 (bs, 1H), 9.44 (s, 1H), 8.06 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 6.31 (m, 1H), 4.74 (m, 2H)
I-a-88		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	3-I	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.7 (bs, 1H), 9.42 (s, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.31 (d, 1H), 6.33 (m, 1H), 4.73 (m, 2H)
I-a-89		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	3-Me	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 9.41 (s, 1H), 7.40 (m, 2H), 6.33 (m, 1H), 4.73 (m, 2H), 2.33 (s, 3H)
I-a-90		C=O	CH ₃	Cl	3-Me	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.2 (bs, 1H), 9.39 (s, 1H), 7.40 (m, 2H), 3.70 (s, 3H), 2.36 (s, 3H)
I-a-91		C=O	CH ₂ CF ₃	Me	3-Br	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 9.43 (s, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 5.13 (m, 2H), 2.16 (s, 3H)
I-a-92		C=O	CH ₃	Cl	3-I	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.5 (bs, 1H), 9.41 (s, 1H), 7.96 (d, 1H), 7.31 (d, 1H), 3.70 (s, 3H)
I-a-93		C=O	CH ₃	Me	3-Br	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 9.38 (s, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.31 (d, 1H), 3.70 (s, 3H), 2.15 (s, 3H)
I-a-94		C=O	CH ₂ CHF ₂	Me	3-Br	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.5 (bs, 1H), 9.41 (s, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 6.34 (m, 1H), 4.74 (m, 2H), 2.16 (s, 3H)

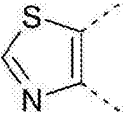
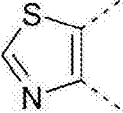
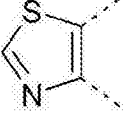
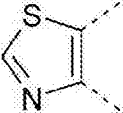
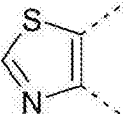
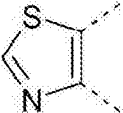
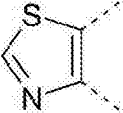
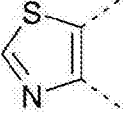
[0714]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-95		C=O	CH ₂ CF ₃	Cl	3-I	6-Cl	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.96 (s, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.14 (t, 1H), 5.13 (m, 2H)
I-a-96		C=O	CH ₂ CHF ₂	Me	4-Br	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 9.39 (s, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 6.34 (m, 1H), 4.74 (m, 2H), 2.31 (m, 2H), 2.10 (s, 3H), 0.99 (m, 3H)
I-a-97		C=O	CH ₂ CHF ₂	Me	4-Br	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.2 (bs, 1H), 9.39 (s, 1H), 7.32 (d, 2H), 6.35 (m, 1H), 4.74 (m, 2H), 2.01 (s, 6H)
I-a-98		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 7.49 (d, 2H), 7.39 (t, 1H), 3.68 (s, 3H), 2.86 (s, 3H)
I-a-99		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.48 (d, 2H), 7.37 (t, 1H), 6.22 (m, 1H), 4.81 (m, 2H), 3.41 (s, 3H)
I-a-10 0		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 7.36 (d, 2H), 7.19 (t, 1H), 3.50 (s, 3H), 3.36 (s, 3H)
I-a-10 1		C=O	CH ₃	Me	4-O-CH ₂ -CF ₃	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.90 (s, 1H), 6.80 (d, 1H), 6.76 (d, 1H), 4.38 (m, 2H), 3.90 (s, 3H), 2.44 (m, 2H), 1.09 (m, 3H)
I-a-10 2		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 12.0 (bs, 1H), 7.54 (d, 2H), 7.43 (t, 1H), 6.36 (m, 1H), 4.70 (m, 2H), 3.12 (s, 3H)
I-a-10 3		C=O	CH ₃	Me	4-Br	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.8 (bs, 1H), 9.36 (s, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.29 (d, 1H), 3.70 (s, 3H), 2.31 (m, 2H), 1.98 (s, 3H), 0.98 (t, 3H)
I-a-10 4		C=O	CH ₂ CHF ₂	Me	4-CF ₂ -CF ₃	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 9.40 (s, 1H), 7.41 (s, 2H), 6.36 (m, 1H), 4.75 (m, 2H), 2.11 (s,

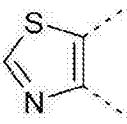
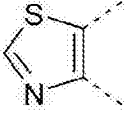
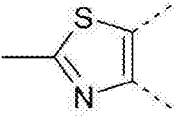
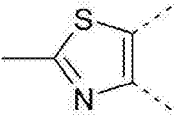
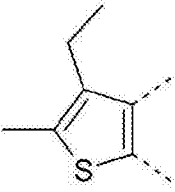
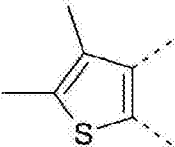
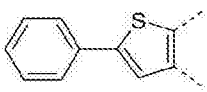
[0715]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
							6H)
I-a-10 5		C=O	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	Me	4-CF ₃	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 9.42 (s, 1H), 7.41 (s, 2H), 5.05 (d, 2H), 3.14 (t, 1H); 2.11 (s, 6H)
I-a-10 6		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.7 (bs, 1H), 7.53 (d, 2H), 7.42 (t, 1H), 3.67 (s, 3H), 3.12 (s, 3H)
I-a-10 7		C=O	CH ₃	Me	4-O-CH ₂ -CF ₃	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.91 (s, 1H), 6.78 (s, 2H), 4.37 (m, 2H), 3.90 (s, 3H), 2.13 (s, 6H)
I-a-10 8		C=O	CH ₃	Me	4-CF ₃	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.0 (bs, 1H), 9.38 (s, 1H), 7.40 (s, 2H), 3.71 (s, 3H); 2.10 (s, 6H)
I-a-10 9		C=O	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	I	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 9.42 (s, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 5.04 (d, 2H), 3.12 (t, 1H); 2.37 (m, 2H), 0.99 (m, 3H)
I-a-11 0		C=O	CH_2CHF_2	I	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 9.41 (s, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 6.32 (m, 1H), 4.75 (m, 2H), 2.36 (m, 2H), 0.97 (m, 3H)
I-a-11 1		C=O	CH ₃	I	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.1 (bs, 1H), 9.38 (s, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 3.70 (s, 3H), 2.36 (m, 2H), 0.99 (m, 3H)
I-a-11 2		C=O	CH_2CHF_2	F	4-Me	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 9.39 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 6.86 (dd, 1H), 6.35 (m, 1H), 4.73 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.06 (s, 3H)

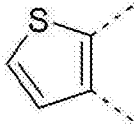
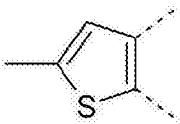
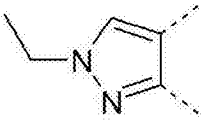
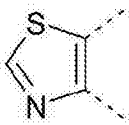
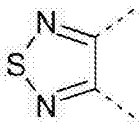
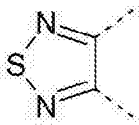
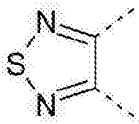
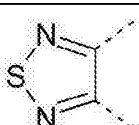
[0716]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-11 3		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Br	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 9.40 (s, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.55 (d, 1H), 6.34 (m, 1H), 4.74 (m, 2H), 2.09 (s, 3H)
I-a-11 4		C=O	CH ₃	F	4-Me	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.9 (bs, 1H), 9.36 (s, 1H), 6.93 (d, 1H), 6.84 (dd, 1H), 3.69 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.04 (s, 3H)
I-a-11 5		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Br	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 9.40 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.52 (d, 1H), 6.33 (m, 1H), 4.74 (m, 2H), 2.39 (m, 2H), 0.98 (m, 3H)
I-a-11 6		C=O	CH ₂ C≡CH	Br	4-Br	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 9.42 (s, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.52 (d, 1H), 5.04 (d, 2H), 3.13 (t, 1H), 2.36 (m, 2H), 1.00 (m, 3H)
I-a-11 7		C=O	CH ₂ C≡CH	Br	4-Br	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 9.42 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.55 (d, 1H), 5.04 (d, 2H), 3.13 (t, 1H), 2.08 (s, 3H)
I-a-11 8		C=O	CH ₃	Br	4-Br	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.1 (bs, 1H), 9.38 (s, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.54 (d, 1H), 3.70 (s, 3H), 2.08 (s, 3H)
I-a-11 9		C=O	CH ₃	Br	4-Br	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.1 (bs, 1H), 9.38 (s, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.51 (d, 1H), 3.70 (s, 3H), 2.37 (m, 2H), 1.00 (t, 3H)
I-a-12 0		C=O	CH ₂ C≡CH	F	4-Me	6-Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 9.41 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 6.86 (dd, 1H), 5.04 (d, 2H), 3.17 (t, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.04 (s, 3H)

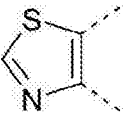
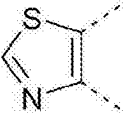
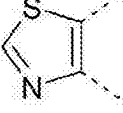
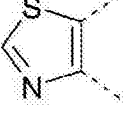
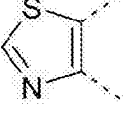
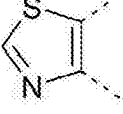
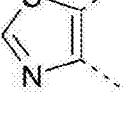
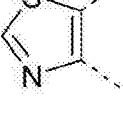
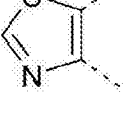
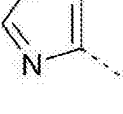
[0717]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-12 1		C=O	CH ₂ CHF ₂	Me	4-(2'- c-Pr) -c-Pr	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.91 (s, 1H), 6.84 (d, 2H), 6.28 (m, 1H), 4.86 (m, 2H), 2.08 (s, 6H), 1.60 (m, 1H), 1.10 (m, 1H) 0.90 (m, 1H), 0.75 (m, 2H), 0.40 (m, 2H), 0.15 (m, 2H)
I-a-12 2		C=O	CH ₃	Me	4-(2'- c-Pr) -c-Pr	Me	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.6 (bs, 1H), 9.33 (s, 1H), 6.74 (d, 2H), 3.69 (s, 3H), 1.94 (s, 6H), 1.60 (m, 1H), 1.10 (m, 1H) 0.90 (m, 1H), 0.75 (m, 2H), 0.40 (m, 2H), 0.15 (m, 2H)
I-a-12 3		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.2 (bs, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.39 (t, 1H), 3.65 (s, 3H), 2.81 (s, 3H)
I-a-12 4		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.5 (bs, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.40 (t, 1H), 6.33 (m, 1H), 4.69 (m, 2H), 2.82 (s, 3H)
I-a-12 5		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Br	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.58 (d, 1H); 7.45 (d, 1H); 6.21 (tt, 1H); 5.39 (s, 1H); 4.38 (m, 2H); 2.82 (m, 2H); 2.47 (m, 2H); 2.39 (s, 3H); 1.15 (t, 3H); 1.11 (t, 3H)
I-a-12 6		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Br	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.37 (d, 1H); 7.23 (d, 1H); 6.05 (tt, 1H); 4.33 (m, 2H); 4.18 (m, 1H); 3.73 (s, 2H); 3.69 (m, 1H); 2.54 (q, 2H); 2.37 (s, 3H); 2.30 (s, 3H); 1.36 (t, 3H); 1.17 (t, 3H)
I-a-12 7		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.71 (d, 1H); 7.69 (m, 1H); 7.62 (d, 1H); 7.46 (m, 3H); 7.35 (m, 2H); 6.16 (tt, 1H); 5.64 (s, 1H); 4.57

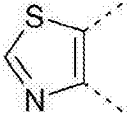
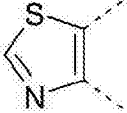
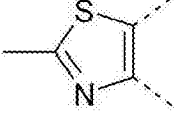
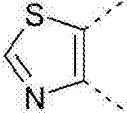
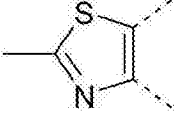
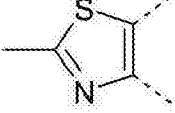
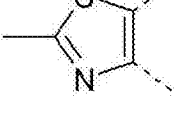
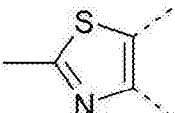
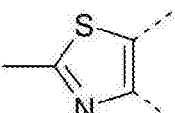
[0718]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
							(m, 2H); 2.51 (m, 2H); 1.13 (t, 3H)
I-a-12 8		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Br	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.47 (d, 1H); 7.40 (d, 1H); 7.33 (d, 1H); 6.92 (d, 1H); 6.12 (tt, 1H); 4.15 (m, 2H); 2.55 (m, 2H); 1.04 (t, 3H)
I-a-12 9		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.59 (d, 1H); 7.32 (d, 1H); 6.94 (q, 1H); 6.20 (tt, 1H); 5.54 (s, 1H); 4.37 (m, 2H); 2.52 (d, 3H); 2.47 (m, 2H); 1.10 (t, 3H)
I-a-13 0		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): 11.11 (s, 1H); 8.24 (s, 1H); 7.60 (d, 1H); 7.36 (d, 1H); 6.31 (tt, 1H); 4.42 (m, 2H); 4.26 (q, 2H); 2.38 (m, 2H); 1.44 (t, 3H); 0.99 (t, 3H)
I-a-13 1		C=O	CH ₃	Br	4-Br	6-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): 11.5 (bs, 1H), 9.41 (s, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 3.69 (s, 3H)
I-a-13 2		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): 12.3 (bs, 1H), 7.59 (m, 2H), 7.45 (m, 1H), 6.38 (m, 1H), 4.65 (m, 2H)
I-a-13 3		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): 12.3 (bs, 1H), 7.55 (d, 2H), 7.44 (t, 1H), 3.61 (s, 3H)
I-a-13 4		C=O	CH ₃	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d ₆ -DMSO): 12.0 (bs, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 3.60 (s, 3H), 2.40 (m, 2H), 1.02 (t, 3H)
I-a-13 5		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.58 (d, 1H), 7.31 (m, 1H), 6.22 (m, 1H), 4.70 (m, 2H), 2.47 (m, 2H), 1.12 (m, 3H)

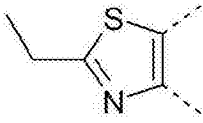
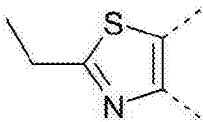
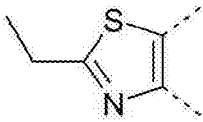
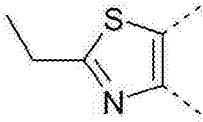
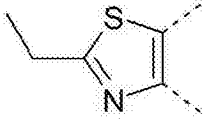
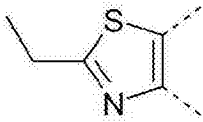
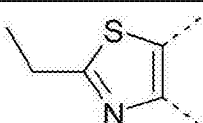
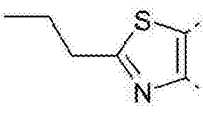
[0719]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-13 6		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Br	6-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.9 (bs, 1H), 9.44 (s, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 6.31 (m, 1H), 4.74 (m, 2H)
I-a-13 7		C=O	CH ₃	Cl	4-Br	6-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.5 (bs, 1H), 9.42 (s, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 3.69 (s, 3H)
I-a-13 8		C=O	CH ₂ C≡CH	Br	4-Br	6-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.7 (bs, 1H), 9.45 (s, 1H), 8.06 (d, 1H), 7.72 (d, 1H), 5.03 (d, 2H), 3.13 (t, 1H)
I-a-13 9		C=O	CH ₂ C≡CH	Cl	4-Br	6-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.8 (bs, 1H), 9.45 (s, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 5.03 (d, 2H), 3.14 (t, 1H)
I-a-14 0		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.9 (bs, 1H), 9.44 (s, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 6.31 (m, 1H), 4.74 (m, 2H)
I-a-14 1		C=O	CH ₃	Br	4-Cl	6-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.5 (bs, 1H), 9.41 (s, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 3.69 (s, 3H)
I-a-14 2		C=O	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	6-F	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.7 (bs, 1H), 9.43 (s, 1H), 7.66 (m, 2H), 7.60 (m, 1H), 6.31 (m, 1H), 4.73 (m, 2H)
I-a-14 3		C=O	CH ₂ C≡CH	Br	4-Cl	6-OCF ₃	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.7 (bs, 1H), 9.45 (s, 1H), 7.95 (d, 1H), 7.63 (d, 1H), 5.04 (d, 2H), 3.13 (t, 1H)
I-a-14 4		C=O	CH ₃	CF ₃	6-F	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 9.41 (s, 1H), 7.65 (m, 2H), 7.59 (m, 1H), 3.69 (s, 3H)
I-a-14 5		C=O	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.8 (bs, 1H), 9.42 (s, 1H), 7.86 (dd, 1H), 7.80 (dd, 1H), 7.63 (t, 1H), 6.30 (m, 1H), 4.73 (m, 2H)

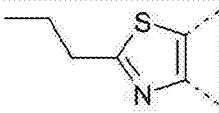
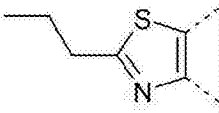
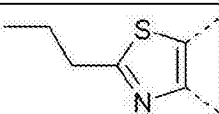
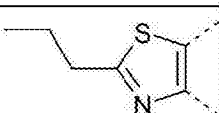
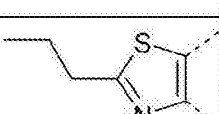
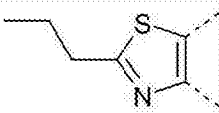
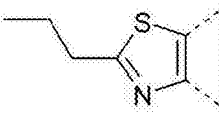
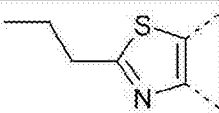
[0720]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-14 6		C=O	CH ₂ C≡CH	CF ₃	6-F	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.96 (s, 1H), 7.57 (dd, 1H), 7.49 (m, 1H), 7.34 (m, 1H), 5.17 (d, 2H), 2.21 (d, 1H)
I-a-14 7		C=O	CH ₃	CF ₃	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 9.40 (s, 1H), 7.87 (dd, 1H), 7.78 (dd, 1H), 7.62 (m, 1H), 3.68 (s, 3H)
I-a-14 8		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 6.33 (m, 1H), 4.69 (m, 2H), 2.81 (s, 3H), 2.37 (m, 2H), 1.00 (t, 3H)
I-a-14 9		C=O	CH ₂ C≡CH	CF ₃	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.98 (s, 1H), 7.66 (m, 2H), 7.43 (m, 1H), 7.34 (m, 1H), 5.16 (d, 2H), 2.21 (d, 1H)
I-a-15 0		C=O	CH ₂ C≡CH	Cl	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.36 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 5.17 (dd, 2H), 2.82 (s, 3H), 2.50 (m, 2H), 2.16 (t, 1H), 1.09 (t, 3H)
I-a-15 1		C=O	CH ₃	Cl	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.40 (d, 1H), 7.26 (s, 1H), 3.82 (s, 3H), 2.82 (s, 3H), 2.44 (m, 2H), 1.09 (t, 3H)
I-a-15 2		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 6.32 (m, 1H), 4.69 (m, 2H), 2.81 (s, 3H), 2.40 (m, 2H), 1.00 (t, 3H)
I-a-15 3		C=O	CH ₂ C≡CH	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.2 (bs, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 4.98 (d, 2H), 2.82 (s, 3H), 3.13 (t, 1H), 2.36 (dq, 2H), 1.00 (dt, 3H)
I-a-15 4		C=O	CH ₃	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.9 (bs, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.38 (s, 1H), 3.65 (s, 3H), 2.80 (s, 3H), 2.36 (m, 2H), 1.00 (m, 3H)

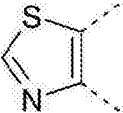
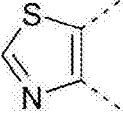
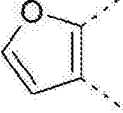
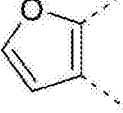
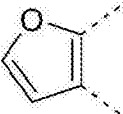
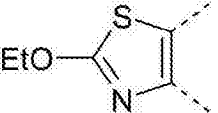
[0721]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-15 5		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 7.51 (d, 2H), 7.40 (t, 1H), 6.33 (m, 1H), 4.69 (m, 2H), 3.12 (q, 2H), 1.37 (t, 3H)
I-a-15 6		C=O	CH ₂ C≡CH	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.40 (t, 1H), 5.00 (d, 2H), 3.14 (m, 2H+1H), 1.38 (t, 3H)
I-a-15 7		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 6.33 (m, 1H), 4.70 (m, 2H), 3.12 (q, 2H), 2.36 (m, 2H), 1.37 (t, 3H), 0.99 (t, 3H)
I-a-15 8		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 7.51 (d, 2H), 7.40 (t, 1H), 3.66 (s, 3H), 3.11 (q, 2H), 1.35 (t, 3H)
I-a-15 9		C=O	CH ₃	Cl	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.9 (bs, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 3.67 (s, 3H), 3.12 (q, 2H), 2.38 (m, 2H), 1.35 (t, 3H), 0.99 (t, 3H)
I-a-16 0		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 6.32 (m, 1H), 4.69 (m, 2H), 3.12 (q, 2H), 2.38 (m, 2H), 1.37 (t, 3H), 0.99 (t, 3H)
I-a-16 1		C=O	CH ₃	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.9 (bs, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), ^3.64 (s, 3H), 3.12 (q, 2H), 2.38 (m, 2H), 1.37 (t, 3H), 1.01 (t, 3H)
I-a-16 2		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.6 (bs, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.40 (t, 1H), 6.33 (m, 1H), 4.69 (m, 2H), 3.08 (t, 2H), 1.77 (q, 2H), 0.97 (t, 3H)

[0722]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-16 3		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.2 (bs, 1H), 7.51 (d, 2H), 7.40 (t, 1H), 3.66 (s, 3H), 3.07 (t, 2H), 1.78 (q, 2H), 0.99 (t, 3H)
I-a-16 4		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 6.32 (m, 1H), 4.69 (m, 2H), 3.07 (t, 2H), 2.37 (m, 2H), 1.80 (m, 2H), 0.99 (m, 6H)
I-a-16 5		C=O	CH ₃	Cl	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.0 (bs, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 3.66 (s, 3H), 3.07 (t, 2H), 2.37 (m, 2H), 1.79 (m, 2H), 1.00 (m, 6H)
I-a-16 6		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.3 (bs, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 6.32 (m, 1H), 4.70 (m, 2H), 3.07 (t, 2H), 2.38 (m, 2H), 1.79 (m, 2H), 0.98 (m, 6H)
I-a-16 7		C=O	CH ₃	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.0 (bs, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 3.70 (s, 3H), 3.07 (t, 2H), 2.37 (m, 2H), 1.79 (m, 2H), 1.00 (m, 6H)
I-a-16 8		C=O	CH ₂ C≡CH	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.33 (d, 1H), 7.14 (m, 1H), 5.17 (dd, 2H), 3.01 (m, 2H), 2.14 (t, 1H), 1.86 (m, 2H), 1.09 (t, 3H)
I-a-16 9		C=O	CH ₂ C≡CH	Cl	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.39 (d, 1H), 7.26 (d, 1H), 5.18 (dd, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.48 (m, 2H), 2.17 (t, 1H), 1.90 (m, 2H), 1.09 (m, 3H)
I-a-17 0		C=O	CH ₂ C≡CH	Br	4-Cl	6-Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.58 (d, 1H), 7.31 (d, 1H), 5.18 (dd, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.48 (m, 2H), 2.17 (t, 1H), 1.92 (m, 2H), 1.10 (m, 3H)

[0723]

编号	A	V	W	X	Y	Z	分析数据
I-a-17 1		C=O	CH ₂ CH ₂ -OCH ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 9.40 (s, 1H), 7.53 (d, 2H), 7.41 (t, 1H), 4.50 (t, 2H), 3.64 (t, 2H), 3.25 (s, 3H)
I-a-17 2		C=O	CH ₂ CH ₂ -SCH ₃	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 9.42 (s, 1H), 7.53 (d, 2H), 7.42 (t, 1H), 4.51 (m, 2H), 2.82 (m, 2H), 2.13 (s, 3H)
I-a-17 3		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.7 (bs, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.38 (t, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.32 (m, 1H), 4.51 (m, 2H),
I-a-17 4		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.6 (bs, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.32 (m, 1H), 4.51 (m, 2H), 2.38 (m 2H), 1.00 (t, 3H)
I-a-17 5		C=O	CH ₂ C≡CH	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.7 (bs, 1H), 8.12 (d, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.38 (t, 1H), 7.07 (d, 1H), 4.91 (d, 2H), 3.29 (t, 1H),
I-a-17 6		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 11.4 (bs, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.39 (t, 1H), 6.32 (m, 1H), 4.60 (m, 4H), 1.42 (t, 3H)

[0724] 3. 7-烯丙基-5-(2,4,6-三甲苯基)-6-氧代-6,7-二氢噻吩并[2,3-b]吡啶-4-基-2-甲基丙酸酯(化合物 I-b-8)的制备:

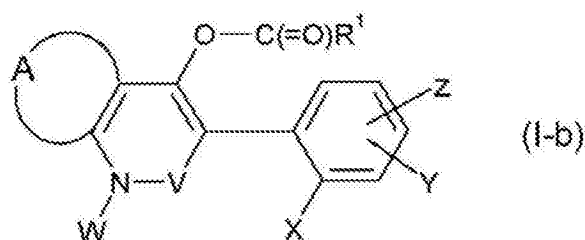
[0725] 首先将 1.1g(3.4mmol) 本发明的化合物 I-a-20 置于 10ml 二氯甲烷中。加入 1.1 当量 2-甲基丙酰氯和 1.3 当量三乙胺并且将混合物在 RT 下搅拌 1 小时。随后向混合物中加入水并且通过萃取柱柱体的方式将相分离。将由此获得的有机相浓缩并且通过硅胶柱层析分离(梯度正庚烷/EtOAc100:0 至 50:50)。这样得到 1.1g 本发明的化合物 I-b-8。

[0726] 4. 3-(2-碘苯基)-2,2-二氧化-1-(2,2,2-三氟乙基)-1H-[1,3]噻唑并[4,5-c][1,2]噻嗪-4-基-2-甲基丙酸酯的制备(化合物 I-b-32):

[0727] 将 150mg(0.31mmol) 3-(2-碘苯基)-1-(2,2,2-三氟乙基)-1H-[1,3]噻唑并[4,5-c][1,2]噻嗪-4-醇 2,2-二氧化物(化合物 I-a-15)溶于 5ml 二氯甲烷中,并且在 RT 下加入 0.04ml(0.46mmol) 吡啶。所述反应混合物在 RT 下搅拌 5 分钟,然后加入 0.04ml(0.4mmol) 2-甲基丙酰氯并将混合物在室温下再搅拌 4 小时。随后减压除去溶剂并且通过制备 HPLC(C₁₈-SiO₂, 梯度乙腈/水 20:80 至 100:0)的方式纯化剩余物。这样得到 47mg 化合物 I-b-32。

[0728] 表 148 :本发明的式 (I) 化合物,其中 G 为 $C(=O)R^1$:

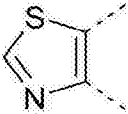
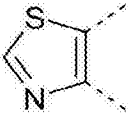
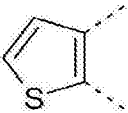
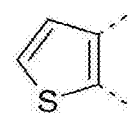
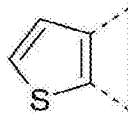
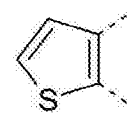
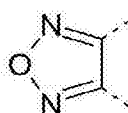
[0729]



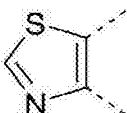
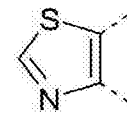
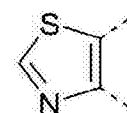
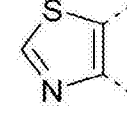
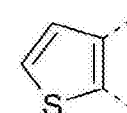
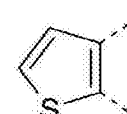
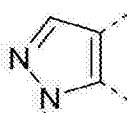
[0730]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ¹	分析数据
I-b-1		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	i-Pr	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.47 (s, 1H); 7.41 (d, 2H); 7.30 (dd, 1H); 6.25 (tt, 1H); 4.30 (td, 2H); 3.93 (s, 3H); 2.57 (m, 1H); 0.98 (d, 6H)
I-b-2		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	H	i-Bu	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 10.6 (bs, 1H); 9.31 (s, 1H); 6.90 (s, 2H); 5.96 (m, 1H); 5.07 (m, 1H); 4.90 (m, 3H); 2.27 (s, 3H); 1.97 (s, 6H)
I-b-3		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	i-Pr	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.88 (s, 1H); 7.45 (m, 2H); 7.34 (m, 1H); 6.24 (tt, 1H); 4.55 (m, 2H); 2.59 (m, 1H); 1.00 (d, 6H)
I-b-4		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	I	H	H	i-Pr	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.86 (s, 1H); 7.95 (d, 1H); 7.51 (dd, 1H); 7.44 (td, 1H); 7.14 (td, 1H); 6.27 (m, 1H); 4.66 (m, 1H); 4.51 (m, 1H); 2.55 (m, 1H); 0.99 (d, 3H); 0.89 (d, 3H)
I-b-5		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	H	H	i-Pr	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.86 (d, 1H); 7.69 (m, 3H); 6.24 (tt, 1H); 4.04 (m, 2H); 2.76 (m,

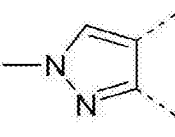
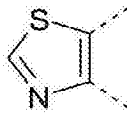
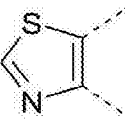
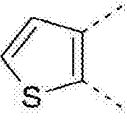
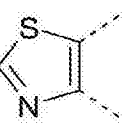
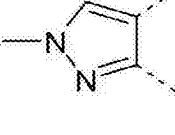
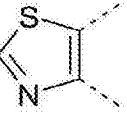
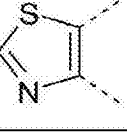
[0731]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ¹	分析数据
I-b-6		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	I	H	H	i-Pr	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 1.28 (d, 6H); 8.86 (s, 1H); 7.95 (d, 1H); 7.51 (dd, 1H); 7.44 (td, 1H); 7.14 (td, 1H); 6.27 (m, 1H); 4.66 (m, 1H); 4.51 (m, 1H); 2.55 (m, 1H); 0.99 (d, 3H); 0.89 (d, 3H)
I-b-7		C=O	CH ₂ -c-Pr	Cl	6-Cl	H	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.93 (s, 1H), 7.41 (d, 2H), 7.26 (m, 1H), 4.40 (d, 2H), 2.38 (q, 2H), 1.45 (m, 1H); 1.02 (t, 3H), 0.50 (m, 4H)
I-b-8		C=O	CH ₂ -CH=CH ₂	Me	4-Me	6-Me	i-Bu	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 6.95 (m, 2H), 6.87 (s, 2H), 5.96 (m, 1H), 5.30 (m, 2H), 4.83 (m, 2H), 2.50 (m, 1H), 2.26 (s, 3H), 2.07 (s, 6H), 0.92 (d, 6H)
I-b-9		C=O	CH ₂ -CH=CH ₂	Br	4-Cl	6-Et	i-Bu	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.51 (d, 1H), 7.25 (s, 1H), 7.00 (d, 1H), 6.93 (d, 1H), 5.94 (m, 1H), 5.33 (m, 2H), 4.84 (m, 2H), 2.60 (m, 1H), 2.48 (m, 2H), 1.12 (t, 3H), 0.99 (d, 6H)
I-b-10		C=O	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	6-Cl	H	i-Bu	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.39 (d, 2H), 7.22 (m, 1H), 7.00 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 5.96 (m, 1H), 5.33 (m, 2H), 4.84 (m, 2H), 2.63 (m, 1H), 0.99 (d, 6H)
I-b-11		C=O	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	4-Cl	H	i-Bu	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.39 (d, 2H), 7.22 (m, 1H), 7.00 (d, 1H), 6.97 (d, 1H), 5.96 (m, 1H), 5.33 (m, 2H), 4.84 (m, 2H), 2.63 (m, 1H), 0.99 (d, 6H)
I-b-12		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	H	i-Pr	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.60 (d, 1H); 7.59 (d, 1H); 7.40 (dd, 1H); 6.23 (tt, 1H); 4.03 (m, 2H); 2.78 (m, 1H); 1.28 (d, 6H)

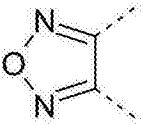
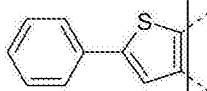
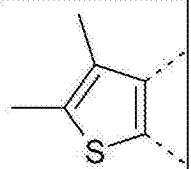
[0732]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ¹	分析数据
I-b-13		C=O	$\text{CH}_2\text{-CH=CH}$ 2	Cl	6-Cl	H	i-Bu	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.94 (s, 1H), 7.40 (d, 2H), 7.26 (m, 1H), 6.07 (m, 1H), 5.28 (m, 1H), 5.23 (m, 1H), 5.15 (m, 2H), 2.62 (m, 1H), 1.03 (d, 6H)
I-b-14		C=O	$\text{CH}_2\text{-CH=CH}$ 2	Br	4-Cl	6-Et	i-Bu	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.93 (s, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.26 (d, 1H), 6.05 (m, 1H), 5.28 (m, 1H), 5.22 (m, 1H), 5.14 (m, 2H), 2.59 (m, 1H), 2.46 (m, 2H), 1.12 (t, 3H), 1.00 (d, 6H)
I-b-15		C=O	$\text{CH}_2\text{-CH=CH}$ 2	Cl	4-Cl	H	i-Bu	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.92 (s, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.34 (dd, 1H), 7.22 (d, 1H), 6.06 (m, 1H), 5.30 (m, 1H), 5.24 (m, 1H), 5.10 (m, 2H), 2.61 (m, 1H), 1.07 (dd, 6H)
I-b-16		C=O	$\text{CH}_2\text{-CH=CH}$ 2	Me	4-Me	6-Me	i-Bu	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.88 (s, 1H), 6.87 (d, 2H), 6.07 (m, 1H), 5.24 (m, 2H), 5.13 (m, 2H), 2.50 (m, 1H), 2.27 (s, 3H), 2.07 (s, 6H), 0.92 (d, 6H)
I-b-17		C=O	CH_2CHF_2	Me	4-Me	6-Me	i-Bu	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.02 (d, 1H), 6.98 (d, 1H), 6.88 (d, 2H), 6.26 (m, 1H), 4.48 (m, 2H), 2.51 (m, 1H), 2.27 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 0.92 (d, 6H)
I-b-18		C=O	CH_2CF_3	Me	4-Me	6-Me	i-Bu	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.02 (d, 1H), 6.95 (d, 1H), 6.87 (d, 2H), 4.85 (m, 2H), 2.52 (m, 1H), 2.26 (s, 3H), 2.06 (s, 3H), 0.92 (d, 6H)
I-b-19		C=O	$\text{CH}_2\text{-CH=CH}$ 2	Cl	4-Cl	H	t-Bu	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.49 (d, 1H), 7.47 (s, 1H), 7.26 (dd, 1H), 7.19 (d, 1H), 6.07 (m, 1H), 5.30 (m, 1H), 5.04 (m, 3H), 4.18 (s, 3H), 1.12 (s, 9H)

[0733]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ¹	分析数据
I-b-20		C=O	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	6-Cl	H	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.52 (s, 1H), 7.38 (d, 2H), 7.23 (m, 1H), 6.04 (m, 1H), 5.21 (m, 2H), 4.85 (m, 2H), 3.99 (s, 3H), 2.37 (q, 2H), 1.02 (t, 3H)
I-b-21		C=O	CH=CH(CH ₃)	Cl	6-Cl	H	t-Bu	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.94 (s, 1H), 7.39 (d, 2H), 7.26 (m, 1H), 6.64 (m, 1H), 6.10 (m, 1H), 1.62 (dd, 3H), 1.09 (d, 9H)
I-b-22		C=O	CH ₂ -CH=CH ₂	Br	4-Cl	Et	t-Bu	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.93 (s, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.26 (d, 1H), 6.05 (m, 1H), 5.22 (m, 2H), 5.14 (m, 2H), 2.47 (m, 2H), 1.12 (t, 3H), 0.88 (d, 9H)
I-b-23		C=O	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	4-Cl	H	t-Bu	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.49 (d, 1H), 7.27 (m, 1H), 7.24 (m, 1H), 7.00 (d, 1H), 6.93 (d, 1H), 5.98 (m, 1H), 5.35 (m, 2H), 4.82 (m, 2H), 1.11 (d, 9H)
I-b-24		C=O	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	6-Cl	H	t-Bu	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.94 (s, 1H), 7.39 (d, 2H), 7.25 (m, 1H), 6.08 (m, 1H), 5.24 (m, 2H), 5.15 (d, 2H), 1.09 (d, 9H)
I-b-25		C=O	CH ₂ CHF ₂	Me	4-Me	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.49 (s, 1H), 6.87 (s, 2H), 6.30 (m, 1H), 4.58 (m, 2H), 3.99 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 2.25 (q, 2H), 2.05 (s, 6H), 0.90 (t, 3H)
I-b-26		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	H	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.97 (s, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.23 (dd, 1H), 6.30 (m, 1H), 4.91 (m, 2H), 2.40 (m, 2H), 1.06 (t, 3H)
I-b-27		C=O	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	6-Cl	H	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.97 (s, 1H), 7.37 (d, 2H), 7.25 (t, 1H), 6.06 (m, 1H), 5.24 (m,

[0734]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ¹	分析数据
								2H), 5.17 (m, 2H), 2.37 (m, 2H), 1.01 (t, 3H)
I-b-28		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	i-Pr	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.48 (m, 2H); 7.40 (dd, 1H); 6.24 (tt, 1H); 4.05 (m, 2H); 2.78 (m, 1H); 1.28 (d, 6H)
I-b-29		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	i-Pr	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.66 (m, 2H); 7.52 (d, 1H); 7.45 (m, 3H); 7.36 (s, 1H); 7.27 (s, 1H); 6.19 (tt, 1H); 4.62 (m, 2H); 2.62 (m, 1H); 2.51 (m, 2H); 1.15 (t, 3H); 1.04 (d, 3H); 1.02 (d, 3H)
I-b-30		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Br	6-Et	i-Pr	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.48 (d, 1H); 7.36 (d, 1H); 6.22 (tt, 1H); 4.43 (m, 2H); 2.49 (m, 3H); 2.37 (s, 3H); 2.19 (s, 3H); 1.14 (t, 3H); 0.91 (s, 3H); 0.87 (d, 3H)

[0735] 5.5-(2,6-二氯苯基)-7-(2,2-二氟乙基)-6-氧代-6,7-二氢噻吩并[2,3-b]吡啶-4-基乙基碳酸酯(化合物 I-c-27)的制备:

[0736] 首先将 0.134g (0.35mmol) 本发明的化合物 I-a-40 置于 5ml 二氯甲烷中。加入 1.3 当量三乙胺并随后加入 1.1 当量氯甲酸乙酯, 将反应混合物在 RT 下搅拌 1 小时。随后向混合物中加入水并且通过萃取柱柱体的方式将相分离。将有机相浓缩并且通过硅胶柱层析分离(梯度正庚烷/EtOAc 100:0 至 50:50)。这样得到 0.1g 本发明的化合物 I-c-27。

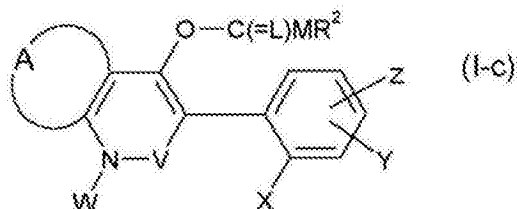
[0737] 6.0-[1-(2,2-二氟乙基)-3-(2-碘苯基)-2,2-二氧-1H-[1,3]噻唑并[4,5-c][1,2]噻嗪-4-基]S-甲基硫代碳酸酯(化合物 I-c-16)的制备:

[0738] 将 150mg (0.3mmol) 1-(2,2-二氟乙基)-3-(2-碘苯基)-1H-[1,3]噻唑并[4,5-c][1,2]噻嗪-4-酚 2,2-二氧化物(化合物 I-a-14)溶于 5ml 二氯甲烷中, 并且在 RT 下加入 0.04ml (0.48mmol) 吡啶。反应混合物在 RT 下搅拌 5 分钟, 然后加入 0.03ml (0.38mmol) 氯硫代甲酸甲酯, 将混合物继续搅拌 4 小时。减压除去溶剂后通过柱层析(SiO₂, 梯度乙酸乙酯/正庚烷 10:90 至 75:25)纯化剩余物。这样得到 144mg 本发明的化合物 I-c-16。

[0739] 类似于提及的实施例(I-c-16 和 I-c-27)并且根据所述制备的一般细节, 获得以下式(I-c)的化合物:

[0740] 表 149: 本发明的式(I)化合物, 其中 G 为 C(=L)MR²:

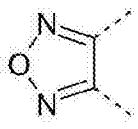
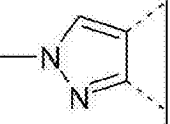
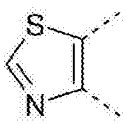
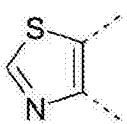
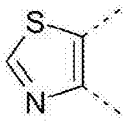
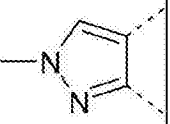
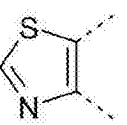
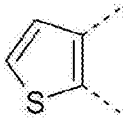
[0741]



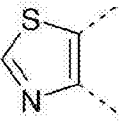
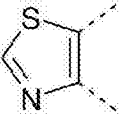
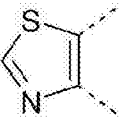
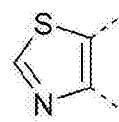
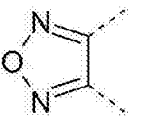
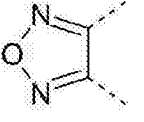
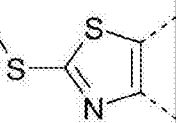
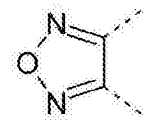
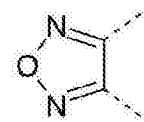
[0742]

编号	A	V	W	X	Y	Z	L	M	R ²	分析数据
I-c-1		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	O	S	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.56 (s, 1H); 7.43 (d, 2H); 7.31 (dd, 1H); 6.24 (tt, 1H); 4.28 (td, 2H); 3.94 (s, 3H); 2.81 (q, 2H); 1.22 (t, 3H)
I-c-2		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	H	O	S	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.89 (s, 1H); 7.55 (d, 1H); 7.45 (d, 1H); 7.35 (dd, 1H); 6.17 (tt, 1H); 4.56 (m, 2H); 2.30 (s, 3H)
I-c-3		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	O	S	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.49 (m, 2H); 7.41 (dd, 1H); 6.21 (tt, 1H); 4.03 (m, 2H); 2.42 (s, 3H)
I-c-4		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	H	O	S	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.89 (s, 1H); 7.54 (d, 1H); 7.45 (d, 1H); 7.35 (dd, 1H); 6.16 (tt, 1H); 4.54 (m, 2H); 2.79 (m, 2H); 1.20 (t, 3H)
I-c-5		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	H	O	S	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.53 (m, 2H); 7.44 (d, 1H); 7.32 (dd, 1H); 6.20 (tt, 1H); 4.30 (m, 2H); 3.93 (s, 3H); 2.30 (s, 3H)
I-c-6		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	H	O	S	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.53 (m, 2H); 7.44 (d, 1H); 7.32 (dd, 1H); 6.21 (tt, 1H); 4.30 (m, 2H); 3.93 (s, 3H); 2.79 (q, 2H); 1.22 (t, 3H)
I-c-7		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	O	S	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.91 (s, 1H); 7.46 (dd, 2H); 7.35 (dd, 1H); 6.23 (tt, 1H); 4.55 (m, 2H); 2.31 (s, 3H)

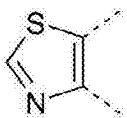
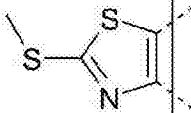
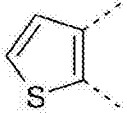
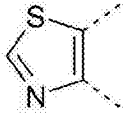
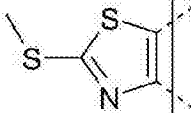
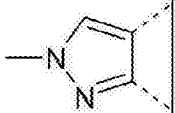
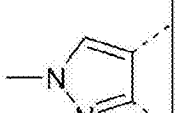
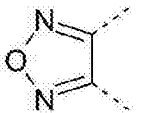
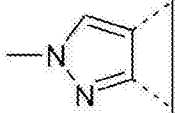
[0743]

编号	A	V	W	X	Y	Z	L	M	R ²	分析数据
I-c-8		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	H	H	O	S	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.87 (d, 1H); 7.69 (m, 3H); 6.21 (tt, 1H); 4.02 (m, 2H); 2.42 (s, 3H)
I-c-9		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	H	H	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.78 (d, 1H); 7.63 (m, 3H); 7.53 (s, 1H); 6.20 (m, 1H); 4.37 (m, 1H); 4.20 (m, 1H); 4.12 (m, 2H); 3.93 (s, 3H); 1.17 (t, 3H)
I-c-10		SO ₂	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	O	S	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.89 (s, 1H); 7.80 (d, 1H); 7.64 (m, 3H); 4.78 (m, 2H); 2.76 (m, 2H); 1.16 (t, 3H)
I-c-11		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	H	H	O	S	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.88 (s, 1H); 7.80 (d, 1H); 7.64 (m, 3H); 6.17 (m, 1H); 4.62 (m, 1H); 4.44 (m, 1H); 2.25 (s, 3H)
I-c-12		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	H	H	O	S	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.87 (s, 1H); 7.81 (m, 1H); 7.65 (m, 3H); 6.17 (m, 1H); 4.63 (m, 1H); 4.44 (m, 1H); 2.75 (m, 2H); 1.16 (t, 3H)
I-c-13		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	H	H	O	S	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.93 (dd, 1H); 7.48 (dd, 1H); 7.45 (s, 1H); 7.41 (td, 1H); 7.11 (td, 1H); 6.27 (tt, 1H); 4.39 (m, 1H); 4.26 (m, 1H); 3.92 (s, 3H); 2.53 (m, 1H); 0.97 (d, 3H); 9.88 (d, 3H)
I-c-14		C=O	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	4-Cl	H	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.93 (s, 1H); 7.52 (d, 1H); 7.26 (d, 1H); 6.05 (m, 1H); 5.28 (m, 1H); 5.22 (m, 1H); 5.14 (m, 2H); 2.59 (m, 1H); 2.46 (m, 2H); 1.12 (t, 3H); 1.00 (d, 6H)
I-c-15		C=O	CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	6-Cl	H	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.92 (s, 1H); 7.50 (d, 1H); 7.34 (dd, 1H); 7.22 (d, 1H); 6.06 (m, 1H); 5.30 (m, 1H); 5.24 (m, 1H); 5.10 (m, 2H); 2.61 (m, 1H); 1.07 (dd, 6H)

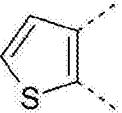
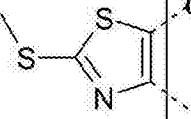
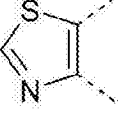
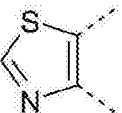
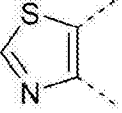
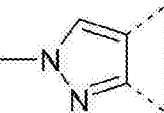
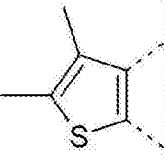
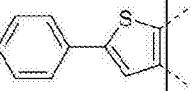
[0744]

编号	A	V	W	X	Y	Z	L	M	R ²	分析数据
I-c-16		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	I	H	H	O	S	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.88 (s, 1H); 7.96 (d, 1H); 7.52 (dd, 1H); 7.46 (td, 1H); 7.17 (td, 1H); 6.27 (m, 1H); 4.66 (m, 1H); 4.49 (m, 1H); 2.27 (s, 3H)
I-c-17		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	I	H	H	O	S	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.88 (s, 1H); 7.96 (d, 1H); 7.53 (dd, 1H); 7.45 (td, 1H); 7.16 (td, 1H); 6.26 (m, 1H); 4.67 (m, 1H); 4.49 (m, 1H); 2.77 (m, 2H); 1.17 (t, 3H)
I-c-18		SO ₂	CH ₂ CF ₃	I	H	H	O	S	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.90 (s, 1H); 7.97 (d, 1H); 7.47 (m, 2H); 7.16 (m, 1H); 4.80 (m, 2H); 2.77 (s, 3H)
I-c-19		SO ₂	CH ₂ CF ₃	I	H	H	O	S	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.89 (s, 1H); 7.95 (d, 1H); 7.49 (dd, 1H); 7.45 (t, 1H); 7.15 (td, 1H); 4.80 (m, 2H); 2.77 (m, 2H); 1.17 (t, 3H)
I-c-20		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	H	H	O	S	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.87 (d, 1H); 7.69 (m, 3H); 6.21 (tt, 1H); 4.01 (m, 2H); 2.96 (q, 2H); 1.38 (t, 3H)
I-c-21		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.42 (m, 2H); 7.33 (m, 1H); 7.10 (m, 2H); 4.29 (q, 2H); 3.72 (s, 3H); 1.32 (m, 3H)
I-c-22		C=O	CH ₃	Me	4-Me	6-Me	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 6.89 (s, 2H); 4.06 (q, 2H); 3.88 (s, 3H); 2.78 (s, 3H); 2.28 (s, 3H); 2.08 (s, 6H); 1.11 (t, 3H)
I-c-23		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	H	O	S	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.60 (m, 2H); 7.40 (dd, 1H); 6.20 (tt, 1H); 4.00 (m, 2H); 2.42 (s, 3H)
I-c-24		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	H	O	S	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.59 (m, 2H); 7.40 (dd, 1H); 6.20 (tt, 1H); 4.00 (m, 2H); 2.95 (q, 2H); 1.38 (t, 3H)

[0745]

编号	A	V	W	X	Y	Z	L	M	R ²	分析数据
I-c-25		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.99 (s, 1H), 7.42 (dd, 2H), 7.32 (m, 1H), 6.30 (m (1H), 4.93 (m, 2H), 4.24 (m, 2H), 1.26 (m, 3H)
I-c-26		C=O	CH ₂ CHF ₂	Me	4-Me	6-Me	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 6.90 (s, 2H), 6.30 (m, 1H), 4.84 (m, 2H), 4.06 (m, 2H), 2.78 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.07 (s, 6H), 1.11 (t, 3H)
I-c-27		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.42 (m, 2H), 7.31 (m, 1H), 7.10 (m, 2H), 6.28 (m, 1H), 4.49 (m, 2H), 4.19 (q, 2H), 1.22 (m, 3H)
I-c-28		C=O	CH ₂ CF ₃	Cl	6-Cl	H	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.98 (s, 1H), 7.42 (dd, 2H), 7.30 (m, 1H), 5.21 (m, 2H), 4.22 (m, 2H), 1.25 (m, 3H)
I-c-29		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.53 (d, 1H), 7.26 (d, 1H), 6.28 (m, 1H), 4.84 (m, 2H), 4.19 (m, 2H), 2.79 (s, 3H), 2.46 (m, 2H), 1.23 (m, 3H), 1.12 (t, 3H)
I-c-30		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.59 (s, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.26 (d, 1H), 6.28 (m, 1H), 4.58 (m, 2H), 4.22 (m, 2H), 2.45 (m, 2H), 1.26 (m, 3H), 1.10 (t, 3H)
I-c-31		C=O	CH ₂ CHF ₂	Me	4-Me	6-Me	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.59 (s, 1H), 6.89 (s, 2H), 6.29 (m, 1H), 4.58 (m, 2H), 4.08 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.07 (s, 6H), 1.15 (t, 3H)
I-c-32		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	O	S	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.49 (m, 2H); 7.41 (dd, 1H); 6.21 (tt, 1H); 4.03 (m, 2H); 2.42 (s, 3H)
I-c-33		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	O	S	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.56 (s, 1H); 7.43 (m, 2H); 7.32 (dd, 1H); 6.24 (tt, 1H); 4.29 (td, 2H); 3.94 (s, 3H); 2.31 (s, 3H)

[0746]

编号	A	V	W	X	Y	Z	L	M	R ²	分析数据
I-c-34		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.52 (d, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.10 (m, 2H), 6.25 (m, 1H), 4.50 (m, 2H), 4.18 (q, 2H), 2.48 (q, 2H), 1.23 (m, 3H), 1.14 (t, 3H)
I-c-35		C=O	CH ₂ CF ₃	Cl	6-Cl	H	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.41 (d, 2H), 7.27 (t, 1H), 5.14 (m, 2H), 4.21 (m, 2H), 2.77 (s, 3H), 1.23 (m, 3H)
I-c-36		C=O	CH ₂ C≡C H	Br	4-Cl	6-Et	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 9.01 (s, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.28 (d, 1H), 5.28 (m, 2H), 4.21 (m, 2H), 2.47 (m, 2H), 2.24 (t, 1H), 1.23 (m, 3H), 1.12 (t, 3H)
I-c-37		C=O	CH ₂ CH ₃	Cl	6-Cl	H	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.97 (s, 1H), 7.41 (dd, 2H), 7.27 (m, 1H), 4.59 (m, 2H), 4.21 (m, 2H), 1.42 (t, 3H), 1.25 (m, 3H)
I-c-38		C=O	CH ₃	Me	4-Br	6-Et	O	O	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.95 (s, 1H), 7.29 (d, 1H), 7.27 (d, 1H), 4.12 (q, 2H), 3.95 (s, 3H), 2.40 (m, 2H), 2.10 (s, 3H), 1.18 (m, 3H), 1.11 (t, 3H)
I-c-39		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	I	H	H	O	S	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.94 (m, 1H); 7.55 (s, 1H); 7.50 (dd, 1H); 7.43 (td, 1H); 7.14 (td, 1H); 6.27 (tdd, 1H); 4.40 (m, 1H); 4.25 (m, 1H); 3.93 (s, 3H); 2.27 (s, 3H)
I-c-40		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Br	6-Et	O	S	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.48 (br s, 1H); 7.37 (br s, 1H); 6.22 (tt, 1H); 4.42 (m, 2H); 2.45 (m, 2H); 2.38 (s, 3H); 2.24 (s, 6H); 1.14 (t, 3H)
I-c-41		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	O	S	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.67 (m, 2H); 7.53 (d, 1H); 7.46 (m, 3H); 7.36 (s, 1H); 7.28 (d, 1H); 6.19 (tt, 1H); 4.62 (m, 2H); 2.49 (m, 2H); 2.32 (s, 3H); 1.15 (t, 3H)

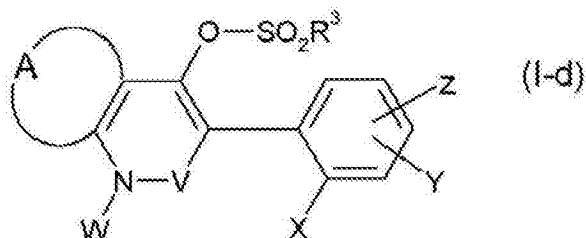
[0747] 6. 4-(2,2-二氟乙基)-6-(2,4,6-三甲苯基)-5-氧代-4,5-二氢[1,3]-噻唑并[4,5-b]吡啶-7-基甲磺酸酯(I-d-1)的制备将0.2g(0.57mmol)本发明的化合物1-a-37溶于5ml二氯甲烷中,首先加入0.075g(1.3当量,0.1ml)三乙胺,然后加入0.05g(1.1当量,0.5ml)甲磺酰氯。将混合物在室温下搅拌1小时,加入10ml水,将有机相移出并且在减

压下浓缩。这样得到 0.221g 作为固体的化合物 I-d-1。

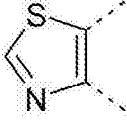
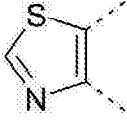
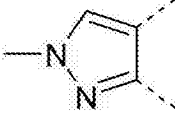
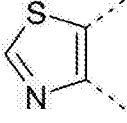
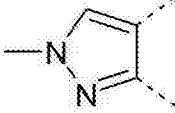
[0748] 类似于提及的实施例并且根据所述制备的一般细节, 获得以下式 (I-d) 的化合物。

[0749] 表 150 : 本发明的式 (I) 化合物, 其中 G 为 SO_2R^3 :

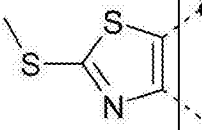
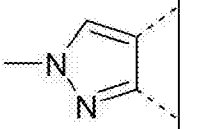
[0750]



[0751]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ³	分析数据
I-d-1		C=O	CH_2CHF_2	Me	4-Me	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl_3): 8.97 (s, 1H), 6.88 (s, 2H), 6.30 (m, 1H), 4.91 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.14 (s, 6H)
I-d-2		C=O	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	Me	3-Br	6-Me	4-Me-phenyl	¹ H NMR (400 MHz, CDCl_3): 9.04 (s, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.21 (d, 2H), 7.13 (d, 2H), 5.27 (d, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.24 (t, 1H), 2.04 (s, 3H), 2.02 (s, 3H)
I-d-3		C=O	$\text{CH}_2\text{-CH=CH}_2$	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl_3): 7.87 (s, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.29 (d, 1H), 6.01 (m, 1H), 5.21 (m, 2H), 4.82 (m, 2H), 4.02 (s, 3H), 2.81 (s, 3H), 2.49 (m, 2H), 1.14 (m, 3H)
I-d-4		C=O	CH_2CHF_2	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl_3): 9.02 (s, 1H), 7.58 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 6.28 (m, 1H), 4.92 (m, 2H), 2.78 (s, 3H), 2.52 (m, 2H), 1.12 (m, 3H)
I-d-5		C=O	CH_2CF_3	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl_3): 7.89 (s, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 4.87 (m, 2H), 4.02 (s, 3H), 2.81 (s, 3H), 2.48 (m, 2H)

[0752]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ³	分析数据
I-d-6		C=O	CH ₂ C≡CH	Cl	6-Cl	H	4-Me-phenyl	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.42 (d, 1H), 7.18 (d, 2H), 7.12 (m, 3H), 5.21 (d, 2H), 2.81 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 2.23 (t, 1H).
I-d-7		C=O	CH ₂ CF ₃	Cl	6-Cl	H	4-Me-phenyl	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.00 (s, 1H), 7.42 (d, 2H), 7.19 (d, 2H), 7.12 (m, 3H), 4.87 (m, 2H), 4.04 (s, 3H), 2.41 (s, 3H).

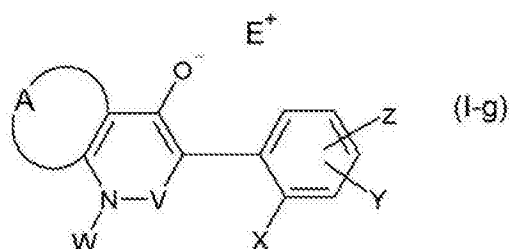
[0753] 7.6-(2,6-二氯苯基)-4-(2,2-二氟乙基)-5-氧代-4,5-二氢[1,3]噻唑并[4,5-b]吡啶-7-醇钠盐(化合物 I-g-1)的制备:

[0754] 将9.14mg钠(0.39mmol)溶于2ml MeOH中,加入0.15g(1.0当量)本发明化合物 I-a-38 的5ml 甲醇溶液。将混合物搅拌10分钟并且在减压下浓缩直至干燥。这样得到化合物 I-g-1。

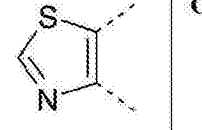
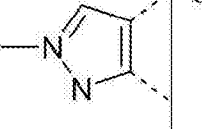
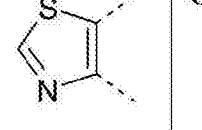
[0755] 类似于提及的实施例并且根据所述制备的一般细节,获得以下化合物(I-g)。

[0756] 表151:本发明的式(I)化合物,其中G为E:

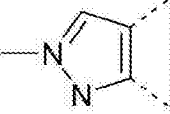
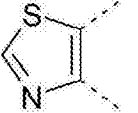
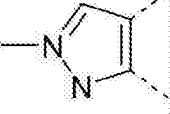
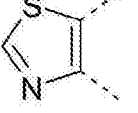
[0757]



[0758]

编号	A	V	W	X	Y	Z	E	分析数据
I-g-1		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	Na ⁺	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 7.35 (d, 2H), 7.18 (t, 1H), 6.22 (m, 1H), 4.53 (m, 2H).
I-g-2		C=O	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	4-Cl	H	Na ⁺	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 7.67 (s, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.21 (d, 2H), 7.16 (dd, 1H), 5.86 (m, 1H), 4.99 (m, 2H), 4.44 (m, 2H), 3.78 (s, 3H).
I-g-3		C=O	CH ₂ CH ₃	Cl	6-Cl	H	K ⁺	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 8.97 (s, 1H), 7.33 (d, 2H), 7.13 (t, 1H), 4.16 (q, 2H), 1.12 (t, 3H).

[0759]

编号	A	V	W	X	Y	Z	E	分析数据
I-g-4		C=O	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	6-Cl	H	N(Me) ₄ ⁺	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 7.63 (s, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.09 (d, 2H), 5.85 (m, 1H), 4.97 (m, 2H), 4.43 (m, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.19 (s, 12H)
I-g-5		C=O	CH ₂ CHF ₂	Me	4-Me	6-Me	N(Me) ₄ ⁺	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 6.72 (s, 2H), 4.53 (m, 2H), 3.17 (s, 12H), 2.21 (s, 3H), 1.98 (s, 6H)
I-g-6		C=O	CH ₂ CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	K ⁺	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 7.70 (s, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.14 (s, 1H), 6.21 (m, 1H), 4.22 (m, 2H), 3.80 (s, 3H), 2.42 (q, 2H), 0.95 (t, 3H)
I-g-7		C=O	CH ₂ CHF ₂	OMe	4-Cl	6-Et	Na ⁺	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 6.77 (d, 1H), 6.73 (d, 1H), 6.21 (m, 1H), 4.52 (m, 2H), 3.56 (s, 3H), 2.35 (q, 2H), 0.96 (t, 3H)

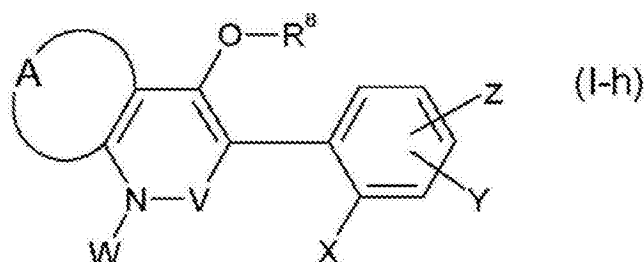
[0760] 8. 1-(2,2-二氟乙基)-3-(2-碘苯基)-4-(丙-2-炔-1-基氧基)-1H-[1,3] 噻唑并 [4,5-c] [1,2] 噻嗪 2,2-二氧化物 (化合物 I-h-2) 的制备

[0761] 将 150mg (0.3mmol) 1-(2,2-二氟乙基)-3-(2-碘苯基)-1H-[1,3] 噻唑并 [4,5-c] [1,2]-噻嗪-4-醇 2,2-二氧化物溶于 3ml DMF 中,并且于 RT 下加入 85mg 碳酸钾。反应混合物在 RT 下搅拌 5 分钟,然后滴加 0.035ml (0.46mmol) 炔丙基溴。反应混合物在 90℃ 下搅拌 4 小时,随后倾入水中并且用乙酸乙酯反复萃取。将合并的有机相干燥 (硫酸钠) 并且浓缩至干燥。通过制备 HPLC (C₁₈-SiO₂, 梯度乙腈 / 水 20 : 80 至 100 : 0) 的方式纯化剩余物。这样得到 51mg 化合物 I-h-3。

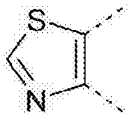
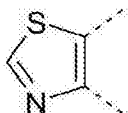
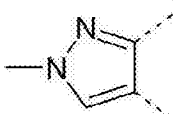
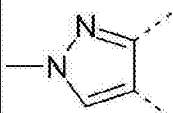
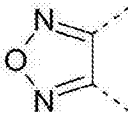
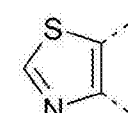
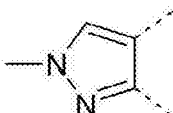
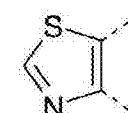
[0762] 类似于实施例 (I-h-2) 并且根据所述制备的一般细节,获得以下式 (I-h) 的化合物。

[0763] 表 152 :本发明的式 (I) 化合物,其中 G 为 R⁸:

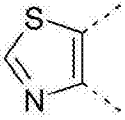
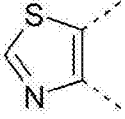
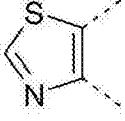
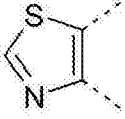
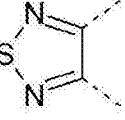
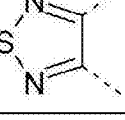
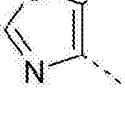
[0764]



[0765]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁸	分析数据
I-h-1		SO ₂	CH ₂ CF ₃	I	H	H	CH ₂ -C≡CH	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.88 (s, 1H); 7.97 (dd, 1H); 7.67 (dd, 1H); 7.48 (td, 1H); 7.18 (td, 1H); 4.74 (m, 2H); 4.40 (dd, 1H); 4.22 (dd, 1H); 2.56 (t, 1H)
I-h-2		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	I	H	H	CH ₂ -C≡CH	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.87 (s, 1H); 7.96 (dd, 1H); 7.72 (dd, 1H); 7.49 (td, 1H); 7.18 (td, 1H); 6.21 (m, 1H); 4.62 (m, 1H); 4.42 (m, 1H); 4.38 (dd, 1H); 4.22 (dd, 1H); 2.56 (t, 1H)
I-h-3		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	I	H	H	CH ₂ -C≡CH	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.94 (dd, 1H); 7.77 (s, 1H); 7.66 (dd, 1H); 7.44 (td, 1H); 7.14 (td, 1H); 6.22 (tt, 1H); 4.32 (m, 1H); 4.33 (m, 1H); 4.19 (m, 1H); 3.94 (s, 3H); 2.55 (t, 1H)
I-h-4		SO ₂	CH ₂ CF ₃	I	H	H	CH ₂ -C≡CH	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.94 (dd, 1H); 7.78 (s, 1H); 7.64 (dd, 1H); 7.44 (td, 1H); 7.13 (td, 1H); 4.56 (m, 1H); 4.40 (m, 1H); 4.38 (dd, 1H); 4.28 (dd, 1H); 3.95 (s, 3H); 2.55 (t, 1H)
I-h-5		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Cl	6-Cl	H	CH ₂ -CH=C H ₂	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.42 (d, 2H); 7.30 (m, 1H); 5.94 (m, 2H); 5.27 (m, 6H); 4.76 (m, 2H)
I-h-6		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	4-Cl	H	CH ₂ CHF ₂	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.97 (s, 1H); 7.56 (d, 1H); 7.37 (dd, 1H); 7.26 (d, 1H); 6.27 (m, 1H); 5.84 (m, 1H); 4.86 (m, 2H); 3.90 (m, 2H)
I-h-7		SO ₂	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	CH ₂ -C≡CH	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.79 (s, 1H); 7.44 (d, 2H); 7.33 (dd, 1H); 6.17 (tt, 1H); 4.41 (d, 2H); 4.21 (td, 2H); 3.95 (s, 3H); 2.53 (t, 1H)
I-h-8		C=O	CH ₂ CHF ₂	CF ₃	H	H	CH ₂ CHF ₂	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.95 (s, 1H); 7.82 (d, 1H); 7.67 (t, 1H); 7.58 (t, 1H); 7.41 (d, 1H); 6.25 (m, 1H); 5.77 (m, 1H); 4.85 (m, 2H); 3.88 (m, 2H)

[0766]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁸	分析数据
I-h-9		C=O	CH ₃	I	H	H	CH ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.91 (s, 1H), 7.94 (d, 1H), 7.41 (t, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.07 (t, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.69 (s, 3H),
I-h-10		C=O	CH ₃	CF ₃	H	H	CH ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.91 (s, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.62 (t, 1H), 7.51 (t, 1H), 7.36 (d, 1H), 3.88 (s, 3H), 3.71 (s, 3H)
I-h-11		C=O	CH ₂ C≡CH	CF ₃	H	H	CH ₂ C≡CH	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.98 (s, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.65 (t, 1H), 7.54 (t, 1H), 7.46 (d, 1H), 5.23 (m, 2H), 4.43 (m, 2H), 2.51 (m, 1H), 2.22 (m, 1H)
I-h-12		C=O	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.96 (s, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.69 (t, 1H), 7.60 (t, 1H), 7.41 (d, 1H), 5.13 (m, 2H), 3.93 (m, 2H)
I-h-13		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	CH ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.42 (d, 2H), 7.29 (t, 1H), 4.27 (s, 3H), 3.78 (s, 3H)
I-h-14		C=O	CH ₂ CHF ₂	Cl	6-Cl	H	CH ₂ CHF ₂	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.44 (d, 2H), 7.32 (t, 1H), 6.23 (m, 1H), 5.95 (m, 1H), 4.94 (m, 2H), 4.73 (m, 2H)
I-h-15		C=O	CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₃	Cl	6-Cl	H	CH ₂ -CH ₂ -S-CH ₃	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.92 (s, 1H), 7.42 (d, 2H), 7.27 (d, 1H), 4.69 (t, 2H), 4.04 (t, 2H), 2.93 (t, 2H), 2.67 (t, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.01 (s, 3H)

[0767] 9. 化合物 II-1 的制备：

[0768] 将 0.5g (1.45mmol) 4-[(2,6-二氯苯基)乙酰基]氨基}-1,3-噻唑-5-羧酸甲酯溶于 10ml 乙腈中, 加入 0.46g (2.5 当量) 硫酸二甲酯和 0.44g 碳酸钾。将混合物在回流下加热沸腾 2.5 小时并且在减压下去除溶剂, 将剩余物溶于 10ml 水中。加入 10ml 二氯甲烷后, 使用萃取柱柱体将相分离并且浓缩有机相。硅胶色谱纯化 (梯度 EtOAc : 正庚烷 1 : 9 至 1 : 1) 获得 0.40g 本发明的化合物 II-1。

[0769] 10. 化合物 II-25 的制备：

[0770] 将 0.75g (2.17mmol) 2-[(2,6-二氯苯基)乙酰基]噻吩-3-羧酸甲酯溶解于 7ml 的 THF 中, 并且加入 1.0g 的氢化钠 (60%)。将混合物搅拌 10 分钟并且然后在 10 分钟内逐滴加入 0.7g (1.5 当量) 的二氟甲烷磺酸 2,2-三氟甲酯的 3ml THF 溶液。随后,

将混合物加热沸腾 2 小时并且去除溶剂。将形成的残留物在 10ml 水和 10ml 二氯甲烷之间分布,并且使用萃取柱柱体分离两相。浓缩有机相。硅胶色谱纯化(梯度 EtOAc : 正庚烷 1 : 9 至 1 : 1) 获得 0.74g 本发明的化合物 II-25。

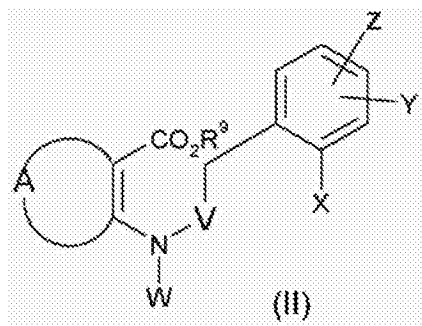
[0771] 11. 化合物 II-42 的制备

[0772] 将 2.0g (9.16mmol) 4-氨基-2-甲硫基-1,3-噻唑-5-羧酸酯首先加入至 40ml 二氧杂环己烷中,于 70℃ 下滴加 1.98g (1.1 当量) 2,4,6-三甲苯基乙酰氯的 10ml 二氧杂环己烷溶液。在回流下加热混合物至沸腾直至不再观察到气体释放。减压除去溶剂后,将混合物溶解于 50ml 二氯甲烷并且用 5% NaHCO₃ 溶液洗涤,将有机相移除并且用硫酸钠干燥。移除溶剂后,将混合物溶解于 1 : 10 的乙酸乙酯 / 正庚烷中并且滤除所形成的沉淀。这样得到 2.7g 本发明的化合物 II-42。

[0773] 类似于上述实施例并且根据所述制备的一般细节,获得以下式 (II) 的化合物:

[0774] 表 153 :本发明的式 (II) 化合物

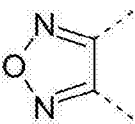
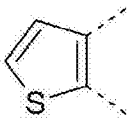
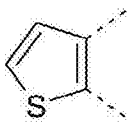
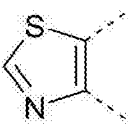
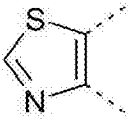
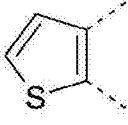
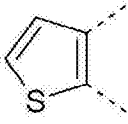
[0775]



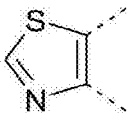
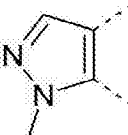
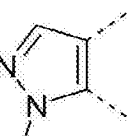
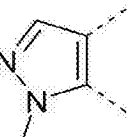
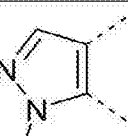
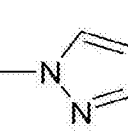
[0776]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-1		C=O	Me	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.87 (s, 1H), 7.32 (m, 2H), 7.10 (m, 1H), 3.93 (s, 3H), 3.82 (bs, 2H), 3.31 (bs, 3H)

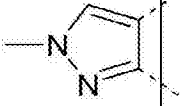
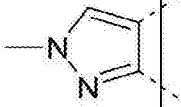
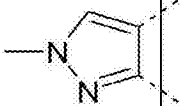
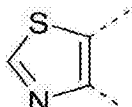
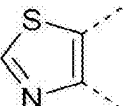
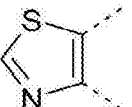
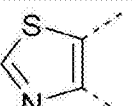
[0777]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-2		C=O	Me	Cl	6-Cl	H	Me	m.p.: 121 – 124°C
II-3		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.47 (d, 1H), 7.22 (d, 3H), 7.10 (m, 1H), 5.87 (m, 1H), 5.12 (m, 2H), 4.60 (m, 1H), 4.05 (m, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.87 (dd, 2H)
II-4		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Me	4-Me	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.43 (d, 1H), 7.22 (d, 1H), 6.82 (s, 2H), 5.87 (m, 1H), 5.09 (m, 2H), 4.60 (m, 1H), 4.03 (m, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.48 (dd, 2H)
II-5		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.87 (s, 1H), 7.27 (m, 2H), 7.10 (m, 1H), 5.87 (m, 1H), 5.07 (m, 2H), 4.43 (m, 2H), 3.94 (s, 3H), 3.81 (bs, 2H)
II-6		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.89 (s, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 5.85 (m, 1H), 5.07 (m, 2H), 4.43 (m, 2H), 3.94 (s, 3H), 3.65 (bs, 2H)
II-7		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.45 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.23 (d, 1H), 7.12 (m, 1H), 5.86 (m, 1H), 5.13 (m, 2H), 4.58 (m, 1H), 4.04 (m, 1H), 3.89 (s, 3H), 3.71 (d, 2H)
II-8		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Cl	4-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.40 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.18 (m, 3H), 5.84 (m, 1H), 5.10 (m, 2H), 4.59 (m, 1H), 4.03 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.63 (dd, 2H)

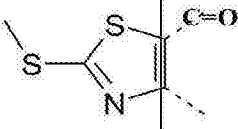
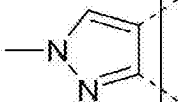
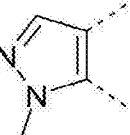
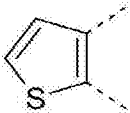
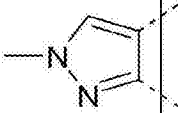
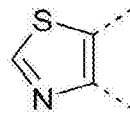
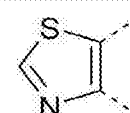
[0778]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-9		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Me	4-Me	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.86 (s, 1H), 6.79 (s, 2H), 5.85 (m, 1H), 5.07 (m, 2H), 4.41 (m, 2H), 3.92 (s, 3H), 3.42 (bs, 2H)
II-10		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Cl	4-Cl	H	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.96 (s, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.19 (dd, 1H), 7.14 (d, 1H), 5.82 (m, 1H), 5.11 (m, 2H), 4.39 (m, 1H), 4.28 (m, 2H), 4.12 (m, 1H), 3.67 (s, 3H), 3.47 (dd, 2H), 1.33 (m, 3H)
II-11		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.01 (s, 1H), 7.29 (d, 2H), 7.15 (t, 1H), 5.83 (m, 1H), 5.13 (m, 2H), 4.44 (m, 1H), 4.15 (m, 1H), 3.87 (s, 3H), 3.87 (d, 1H), 3.49 (d, 1H)
II-12		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Br	4-Cl	6-Et	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.01 (s, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.15 (dd, 1H), 7.14 (d, 1H), 5.85 (m, 1H), 5.11 (m, 2H), 4.44 (m, 1H), 4.38 (m, 1H), 4.27 (m, 1H), 4.12 (m, 1H), 3.88 (s, 3H), 3.64 (d, 1H), 3.40 (d, 1H), 2.59 (m, 2H), 1.36 (t, 3H), 1.15 (t, 3H)
II-13		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Me	4-Me	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.00 (s, 1H), 6.82 (s, 2H), 5.84 (m, 1H), 5.10 (m, 2H), 4.54 (m, 1H), 4.38 (m, 1H), 4.27 (m, 1H), 4.02 (m, 1H), 3.72 (s, 3H), 3.42 (d, 1H), 3.17 (d, 1H), 2.24 (s, 3H), 2.14 (s, 6H)
II-14		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Cl	4-Cl	H	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.86 (s, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.20 (dd, 1H), 7.14 (d, 1H), 5.85 (m, 1H), 5.09 (m, 2H), 4.31

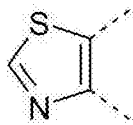
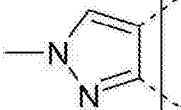
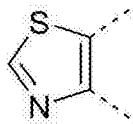
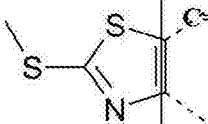
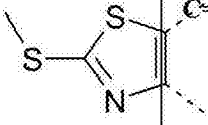
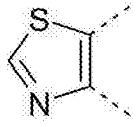
[0779]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
								(m, 2H), 4.22 (m, 2H), 3.89 (s, 3H), 3.62 (s, 2H), 1.31 (t, 3H)
II-15		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Cl	6-Cl	H	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.93 (s, 1H), 7.26 (d, 2H), 7.09 (dd, 1H), 5.87 (m, 1H), 5.11 (m, 2H), 4.31 (m, 4H), 3.93 (s, 3H), 3.81 (s, 2H), 1.35 (t, 3H)
II-16		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Br	4-Cl	6-Et	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.93 (s, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.10 (d, 1H), 5.86 (m, 1H), 5.11 (m, 2H), 4.29 (m, 4H), 3.93 (s, 3H), 3.66 (s, 2H), 2.60 (m, 2H), 1.34 (dt, 3H), 1.14 (t, 3H)
II-17		C=O	CH ₂ -CH=C H ₂	Me	4-Me	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.90 (s, 1H), 6.78 (s, 2H), 5.87 (m, 1H), 5.10 (m, 2H), 4.29 (m, 4H), 3.92 (s, 3H), 3.43 (s, 2H), 2.21 (s, 3H), 2.16 (s, 6H), 1.34 (dt, 3H)
II-18		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.86 (s, 1H), 7.27 (d, 2H), 7.11 (t, 1H), 6.10 (m, 1H), 4.11 (m, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.86 (s, 2H)
II-19		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Me	4-Me	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.87 (s, 1H), 6.80 (s, 2H), 6.09 (m, 1H), 4.09 (m, 2H), 3.93 (s, 3H), 3.46 (s, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.16 (s, 6H)
II-20		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	4-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.85 (s, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.17 (d, 2H), 6.08 (m, 1H), 4.09 (m, 2H), 3.88 (s, 3H), 3.64 (s, 2H)
II-21		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.90 (s, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.13 (d, 2H), 6.08 (m, 1H), 4.11 (m, 2H), 3.94 (s,

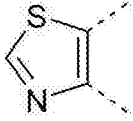
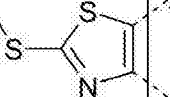
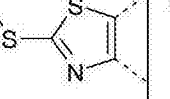
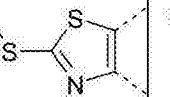
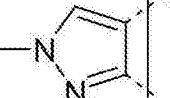
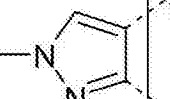
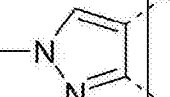
[0780]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
								3H), 3.68 (s, 2H), 2.60 (m, 2H), 1.16 (t, 3H)
II-22		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	6-Cl	H	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.27 (d, 2H), 7.11 (t, 1H), 6.08 (m, 1H), 4.36 (m, 2H), 4.07 (m, 2H), 3.94 (s, 2H), 2.68 (s, 3H), 1.36 (t, 3H)
II-23		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	6-Cl	H	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.94 (s, 1H), 7.26 (d, 2H), 7.11 (dd, 1H), 6.08 (m, 1H), 4.31 (m, 2H), 4.05 (m, 2H), 3.94 (s, 3H), 3.85 (s, 2H), 1.34 (t, 3H)
II-24		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	6-Cl	H	Et	¹ H NMR (400 MHz, d6-DMSO): 8.04 (s, 1H), 7.48 (d, 2H), 7.32 (t, 1H), 6.23 (m, 1H), 5.13 (m, 2H), 4.23 (m, 4H), 3.89 (s, 3H), 3.87 (d, 1H), 3.54 (d, 1H), 1.28 (t, 3H)
II-25		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.45 (d, 1H), 7.28 (m, 3H), 7.14 (m, 1H), 6.11 (m, 1H), 4.23 (m, 2H), 3.90 (s, 3H), 3.87 (m, 2H)
II-26		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Me	4-Me	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.91 (s, 1H), 6.75 (s, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.29 (m, 2H), 4.01 (broad, 3H), 3.94 (s, 3H), 3.46 (s, 2H), 1.34 (t, 3H)
II-27		C=O	CH ₂ -C≡CH	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.91 (s, 1H), 7.27 (d, 2H), 7.11 (t, 1H), 4.67 (d, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.84 (s, 2H), 2.14 (t, 1H)
II-28		C=O	CH ₂ -CF ₃	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.91 (s, 1H), 7.28 (d, 2H), 7.13 (t, 1H), 4.51 (q, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.86 (s,

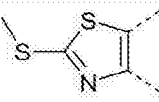
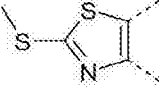
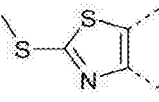
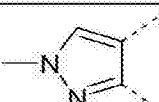
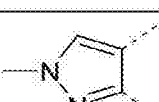
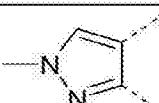
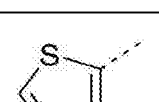
[0781]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
								2H)
II-29		C=O	CH ₂ -CF ₃	Me	4-Me	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.91 (s, 1H), 6.80 (s, 2H), 4.48 (q, 2H), 3.94 (s, 3H), 3.47 (s, 2H), 2.26 (s, 3H), 2.14 (s, 6H)
II-30		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.94 (s, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.06 (m, 1H), 4.31 (m, 2H), 4.05 (m, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.69 (s, 2H), 2.58 (q, 2H), 1.35 (t, 3H), 1.14 (t, 3H)
II-31		C=O	CH ₂ -CF ₃	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.94 (s, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 4.51 (q, 2H), 3.95 (s, 3H), 3.65 (s, 2H), 2.60 (m, 2H), 1.20 (m, 3H)
II-32		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.39 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.06 (m, 1H), 4.35 (m, 2H), 4.07 (m, 2H), 3.77 (s, 2H), 2.70 (s, 3H), 2.61 (m, 2H), 1.37 (t, 3H), 1.16 (t, 3H)
II-33		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Me	4-Me	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 6.79 (s, 2H), 6.07 (m, 1H), 4.35 (m, 2H), 4.05 (m, 2H), 3.54 (s, 2H), 2.70 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 2.17 (s, 6H), 1.39 (m, 3H)
II-34		C=O	CH ₂ -C≡CH	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.93 (s, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 4.68 (s, 2H), 3.94 (s, 3H), 3.67 (s, 2H), 2.61 (m, 2H), 2.14 (s, 1H), 1.16 (m, 3H)

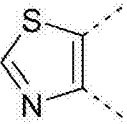
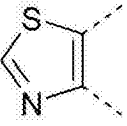
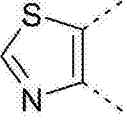
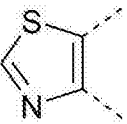
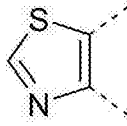
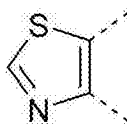
[0782]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-35		C=O	CH ₂ -C≡CH	Me	4-Me	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.90 (s, 1H), 6.79 (s, 2H), 4.64 (s, 2H), 3.92 (s, 3H), 3.46 (s, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.16 (s, 1H), 2.13 (s, 6H)
II-36		C=O	CH ₂ -CF ₃	Cl	6-Cl	H	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.27 (d, 2H), 7.11 (t, 1H), 4.46 (q, 2H), 4.37 (m, 2H), 3.95 (s, 2H), 2.71 (s, 3H), 1.37 (t, 3H)
II-37		C=O	CH ₂ -CF ₃	Br	4-Cl	6-Et	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.39 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 4.45 (q, 2H), 4.36 (m, 2H), 3.78 (s, 2H), 2.71 (s, 3H), 2.61 (m, 2H), 1.37 (t, 3H), 1.16 (t, 3H)
II-38		C=O	CH ₂ -CF ₃	Me	4-Me	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 6.79 (s, 2H), 4.43 (q, 2H), 4.35 (m, 2H), 3.58 (s, 2H), 2.71 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.17 (s, 6H), 1.36 (t, 3H)
II-39		C=O	CH ₂ -CF ₃	Cl	6-Cl	H	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.96 (s, 1H), 7.27 (d, 2H), 7.12 (dd, 1H), 4.42 (q, 2H), 4.31 (m, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.86 (s, 2H), 1.34 (t, 3H)
II-40		C=O	CH ₂ -CF ₃	Br	4-Cl	6-Et	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.96 (s, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 4.41 (q, 2H), 4.30 (m, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.70 (s, 2H), 2.58 (q, 2H), 1.34 (t, 3H), 1.15 (t, 3H)
II-41		C=O	CH ₂ -CF ₃	Me	4-Me	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.93 (s, 1H), 6.79 (s, 2H), 4.40 (m, 2H), 4.29 (m, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.46 (s, 2H), 2.22 (s, 3H), 2.14 (s, 6H), 1.33 (t, 3H)

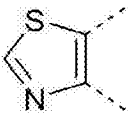
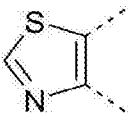
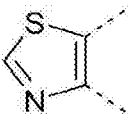
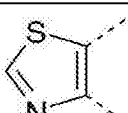
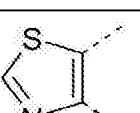
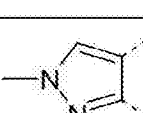
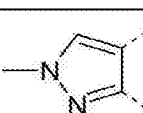
[0783]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-42		C=O	CH ₂ -C≡CH	Cl	6-Cl	H	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.26 (m, 2H); 7.10 (dd, 1H); 4.63 (d, 2H); 4.35 (q, 2H); 3.92 (br s, 2H); 2.70 (s, 3H); 2.14 (br s, 1H); 1.37 (t, 3H)
II-43		C=O	CH ₂ -C≡CH	Br	4-Cl	6-Et	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.38 (d, 1H); 7.12 (d, 1H); 4.61 (d, 2H); 4.35 (q, 2H); 3.76 (br s, 2H); 2.71 (s, 3H); 2.62 (q, 2H); 2.14 (br s, 1H); 1.37 (t, 3H); 1.16 (t, 3H)
II-44		C=O	CH ₂ -C≡CH	Me	4-Me	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 6.78 (s, 2H); 4.60 (d, 2H); 4.34 (q, 2H); 3.54 (br s, 2H); 2.71 (s, 3H); 2.22 (s, 3H); 2.17 (s, 6H); 2.13 (br s, 1H); 1.36 (t, 3H)
II-45		C=O	CH ₂ -C≡CH	Cl	6-Cl	H	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.95 (s, 1H); 7.25 (m, 2H); 7.14 (t, 1H); 4.59 (d, 2H); 4.29 (q, 2H); 3.96 (s, 3H); 3.84 (s, 2H); 2.15 (t, 1H); 1.34 (t, 3H)
II-46		C=O	CH ₂ -C≡CH	Br	4-Cl	6-Et	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.96 (s, 1H); 7.37 (d, 1H); 7.11 (d, 1H); 4.59 (d, 2H); 4.29 (q, 2H); 3.97 (s, 3H); 3.69 (s, 2H); 2.60 (q, 2H); 2.15 (t, 1H); 1.34 (t, 3H); 1.14 (t, 3H)
II-47		C=O	CH ₂ -C≡CH	Me	4-Me	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.92 (s, 1H); 6.77 (s, 2H); 4.57 (br s, 2H); 4.28 (q, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.46 (s, 2H); 2.21 (s, 3H); 2.15 (s, 6H); 2.14 (t, 1H); 1.33 (t, 3H)
II-48		C=O	CH ₂ -c-Pr	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.88 (s, 1H); 7.26 (m, 2H); 7.10 (t, 1H); 3.94 (s, 3H); 3.81 (s, 2H); 3.71 (d, 2H); 0.98 (m, 1H); 0.37 (m, 2H); 0.03

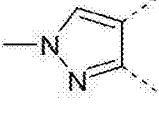
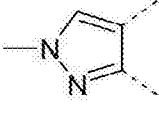
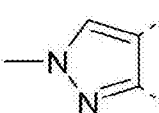
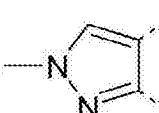
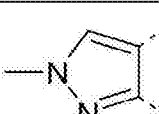
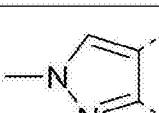
[0784]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
								(m, 2H)
II-49		C=O	CH ₂ -C≡CH	Cl	4-Cl	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.91 (s, 1H); 7.18 (s, 1H); 7.06 (d, 1H); 4.65 (d, 2H); 3.93 (s, 3H); 3.64 (s, 2H); 2.27 (s, 3H); 2.15 (br s, 1H)
II-50		C=O	CH ₂ -C≡CH	Me	3-Br	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.92 (s, 1H); 7.32 (d, 1H); 6.83 (d, 1H); 4.64 (s, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.56 (s, 2H); 2.30 (s, 3H); 2.16 (s, 4H)
II-51		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.90 (s, 1H); 7.20 (br s, 1H); 7.09 (d, 1H); 6.07 (tt, 1H); 4.10 (td, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.65 (s, 2H); 2.59 (q, 2H); 1.16 (t, 3H)
II-52		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	4-Cl	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.88 (s, 1H); 7.19 (s, 1H); 7.07 (s, 1H); 6.08 (tt, 1H); 4.10 (m, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.65 (s, 2H); 2.27 (s, 3H)
II-53		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Me	3-Br	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.90 (s, 1H); 7.33 (d, 1H); 6.84 (d, 1H); 6.08 (tt, 1H); 4.09 (td, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.57 (s, 2H); 2.29 (s, 3H); 2.15 (s, 3H)
II-54		C=O	CH ₂ -C≡CH	Cl	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.93 (s, 1H); 7.20 (d, 1H); 7.08 (d, 1H); 4.66 (d, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.63 (s, 2H); 2.60 (q, 2H); 2.14 (br s, 1H); 1.16 (t, 3H)

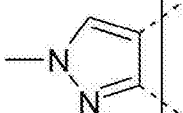
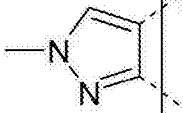
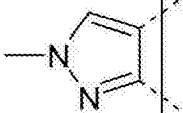
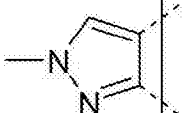
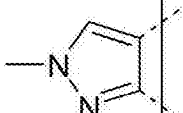
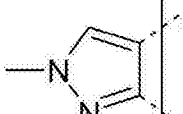
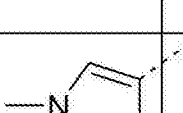
[0785]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-55		C=O	CH ₂ -C≡CH	Me	4-Cl	6-CF ₃	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.96 (s, 1H); 7.46 (s, 1H); 7.36 (s, 1H); 4.64 (d, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.58 (s, 2H); 2.31 (s, 3H); 2.14 (br s, 1H)
II-56		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Me	4-Cl	6-CF ₃	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.94 (s, 1H); 7.47 (d, 1H); 7.37 (s, 1H); 6.05 (tt, 1H); 4.10 (td, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.60 (s, 2H); 2.30 (s, 3H)
II-57		C=O	CH ₂ -C≡CH	Et	4-Cl	6-O Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.82 (s, 1H); 6.77 (d, 1H); 6.60 (d, 1H); 4.63 (d, 2H); 3.92 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 3.52 (s, 2H); 2.54 (q, 2H); 2.12 (br s, 1H); 1.14 (t, 3H)
II-58		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Et	4-Cl	6-O Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.78 (s, 1H); 6.77 (d, 1H); 6.60 (d, 1H); 6.08 (tt, 1H); 4.07 (td, 2H); 3.93 (s, 3H); 3.70 (s, 3H); 3.53 (s, 2H); 2.53 (q, 2H); 1.14 (t, 3H)
II-59		C=O	CH ₂ -C≡CH	Cl	4-Br	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.92 (s, 1H); 7.35 (d, 1H); 7.23 (d, 1H); 4.65 (d, 2H); 3.93 (s, 3H); 3.63 (s, 2H); 2.60 (q, 2H); 2.14 (br s, 1H); 1.16 (t, 3H)
II-60		C=O	CH ₂ -C≡CH	Cl	4-Cl	6-Et	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.96 (s, 1H); 7.19 (d, 1H); 7.06 (d, 1H); 4.58 (s, 2H); 4.29 (q, 2H); 3.97 (s, 3H); 3.64 (s, 2H); 2.58 (q, 2H); 2.16 (t, 1H); 1.34 (t, 3H); 1.15 (t, 3H)
II-61		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	4-Cl	6-Et	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.94 (s, 1H); 7.21 (d, 1H); 7.07 (d, 1H); 6.06 (tt, 1H); 4.31 (q, 2H); 4.02 (td, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.65 (s, 2H); 2.57 (q, 2H); 1.34 (t, 3H);

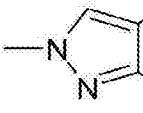
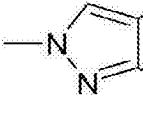
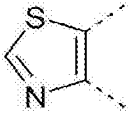
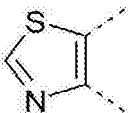
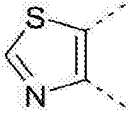
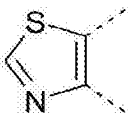
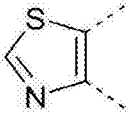
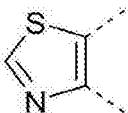
[0786]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
								1.15 (t, 3H)
II-62		C=O	CH ₃	Cl	4-Cl	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.92 (s, 1H); 7.17 (d, 1H); 7.04 (s, 1H); 4.28 (q, 2H); 3.93 (s, 3H); 3.62 (s, 2H); 3.24 (s, 3H); 2.25 (s, 3H); 1.33 (t, 3H)
II-63		C=O	CH ₂ -CF ₃	Cl	4-Cl	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.93 (s, 1H); 7.19 (s, 1H); 7.05 (s, 1H); 6.06 (tt, 1H); 4.29 (q, 2H); 4.02 (br s, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.66 (s, 2H); 2.24 (s, 3H); 1.34 (t, 3H)
II-64		C=O	CH ₃	Cl	4-Cl	6-Et	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.95 (s, 1H); 7.19 (d, 1H); 7.06 (d, 1H); 4.40 (br s, 1H); 4.30 (q, 2H); 3.96 (s, 3H); 3.67 (s, 2H); 2.24 (s, 3H); 1.34 (t, 3H)
II-65		C=O	CH ₂ -C≡CH	Cl	4-Cl	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.94 (s, 1H); 7.18 (d, 1H); 7.04 (s, 1H); 4.57 (br s, 2H); 4.28 (q, 2H); 3.96 (s, 3H); 3.65 (s, 2H); 2.25 (s, 3H); 2.16 (t, 1H); 1.33 (t, 3H)
II-66		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	4-Cl	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.94 (s, 1H); 7.19 (d, 1H); 7.06 (d, 1H); 4.29 (q, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.62 (s, 2H); 3.24 (s, 3H); 2.58 (q, 2H); 1.34 (t, 3H); 1.15 (t, 3H)
II-67		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Me	4-CF ₂ -CF ₃	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.92 (s, 1H); 7.19 (s, 2H); 6.07 (tt, 1H); 4.31 (q, 2H); 4.02 (br s, 1H); 3.95 (s, 3H); 3.56 (s, 2H); 2.26 (s, 6H); 1.35 (t, 3H)

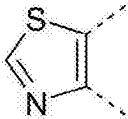
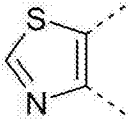
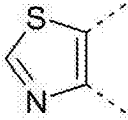
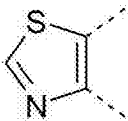
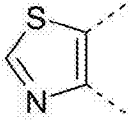
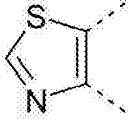
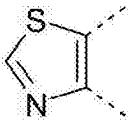
[0787]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-68		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	3-Br	6-Cl	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.95 (s, 1H); 7.47 (d, 1H); 7.16 (d, 1H); 6.08 (tt, 1H); 4.31 (q, 2H); 4.03 (br t, 2H); 3.96 (s, 3H); 3.92 (s, 2H); 3.41 (br t, 1H); 1.35 (t, 3H)
II-69		C=O	CH ₂ -CF ₃	Me	4-CF ₂ -CF ₃	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.94 (s, 1H); 7.19 (s, 2H); 4.40 (br s, 2H); 4.31 (q, 2H); 3.96 (s, 3H); 3.57 (s, 2H); 2.25 (s, 6H); 1.34 (t, 3H)
II-70		C=O	CH ₃	Me	4-CF ₂ -CF ₃	6-Me	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.91 (s, 1H); 7.17 (s, 2H); 4.30 (q, 2H); 3.93 (s, 3H); 3.52 (s, 2H); 3.24 (s, 3H); 2.26 (s, 6H); 1.34 (t, 3H)
II-71		C=O	CH ₂ -CF ₃	Cl	3-Br	6-Cl	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.97 (s, 1H); 7.47 (d, 1H); 7.16 (d, 1H); 4.42 (br s, 2H); 4.31 (q, 2H); 3.97 (s, 3H); 3.93 (s, 2H); 1.35 (t, 3H)
II-72		C=O	CH ₃	Cl	3-Br	6-Cl	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.95 (s, 1H); 7.44 (d, 1H); 7.14 (d, 1H); 4.30 (q, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.88 (s, 2H); 3.25 (s, 3H); 1.34 (t, 3H)
II-73		C=O	CH ₂ -C≡CH	Cl	3-Br	6-Cl	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.96 (s, 1H); 7.45 (d, 1H); 7.14 (d, 1H); 4.59 (br s, 2H); 4.30 (q, 2H); 3.97 (s, 3H); 3.91 (s, 2H); 2.17 (t, 1H); 1.34 (t, 3H)
II-74		C=O	CH ₃	F	3-Me	6-Cl	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.90 (s, 1H); 6.98 (m, 2H); 4.29 (q, 2H); 3.92 (s, 3H); 3.64 (s, 2H); 3.24 (s, 3H); 2.20 (s, 3H); 1.33 (t, 3H)

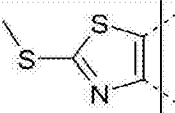
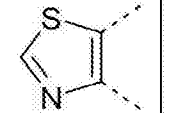
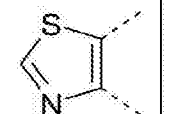
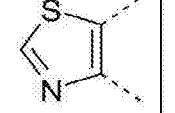
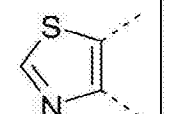
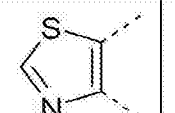
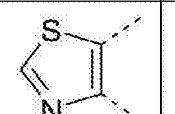
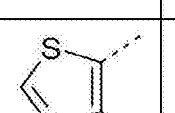
[0788]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-75		C=O	CH ₂ -C≡CH	F	3-Me	6-Cl	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.92 (s, 1H); 6.99 (m, 2H); 4.57 (d, 2H); 4.28 (q, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.68 (s, 2H); 2.20 (d, 3H); 2.15 (t, 1H); 1.33 (t, 3H)
II-76		C=O	CH ₂ -CF ₃	F	3-Me	6-Cl	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.93 (s, 1H); 7.00 (m, 2H); 4.41 (br q, 2H); 4.30 (q, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.70 (s, 2H); 2.20 (d, 3H); 1.34 (t, 3H)
II-77		C=O	CH ₃	I	H	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.82 (s, 1H); 7.74 (d, 1H); 7.28 (m, 2H); 6.88 (t, 1H); 3.85 (s, 3H); 3.68 (br s, 2H); 3.32 (s, 3H)
II-78		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	3-c-P r	6-Cl	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.86 (s, 1H); 7.16 (d, 1H); 6.80 (d, 1H); 6.11 (tt, 1H); 4.12 (td, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.89 (s, 2H); 2.10 (m, 1H); 0.99 (m, 2H); 0.63 (m, 2H)
II-79		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	3-Br	6-Cl	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.88 (s, 1H); 7.47 (d, 1H); 7.16 (d, 1H); 6.09 (tt, 1H); 4.11 (td, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.91 (s, 2H)
II-80		C=O	CH ₂ -C≡CH	CF ₃	H	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.89 (s, 1H); 7.58 (d, 1H); 7.49 (t, 1H); 7.41 (d, 1H); 7.33 (t, 1H); 4.65 (d, 2H); 3.90 (s, 3H); 3.68 (br s, 2H); 2.16 (br s, 1H)
II-81		C=O	CH ₃	Cl	3-Me	6-Cl	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.86 (s, 1H); 7.16 (d, 1H); 7.05 (d, 1H); 3.94 (s, 3H); 3.82 (s, 2H); 3.32 (s, 3H); 2.32 (s, 3H)
II-82		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	3-Me	6-Cl	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.86 (s, 1H); 7.17 (d, 1H); 7.06 (d, 1H); 6.10 (tt, 1H); 4.11 (td, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.87 (s, 2H);

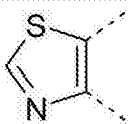
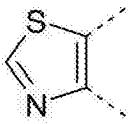
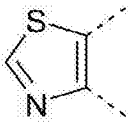
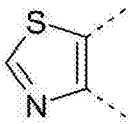
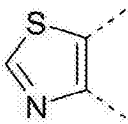
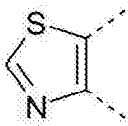
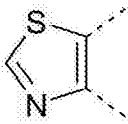
[0789]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
								2.32 (s, 3H)
II-83		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	3-I	6-Cl	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.87 (s, 1H); 7.69 (d, 1H); 7.01 (d, 1H); 6.09 (tt, 1H); 4.11 (td, 2H); 3.95 (s, 5H)
II-84		C=O	CH ₂ -CF ₃	Me	3-Br	6-Cl	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.92 (s, 1H); 7.38 (d, 1H); 7.05 (d, 1H); 4.49 (q, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.79 (s, 2H); 2.38 (s, 3H)
II-85		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Me	3-Br	6-Cl	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.88 (s, 1H); 7.38 (d, 1H); 7.04 (d, 1H); 6.08 (tt, 1H); 4.10 (td, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.78 (s, 2H); 2.38 (s, 3H)
II-86		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Me	4-Br	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.91 (s, 1H); 7.14 (s, 2H); 6.08 (tt, 1H); 4.08 (td, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.45 (s, 2H); 2.48 (q, 2H); 2.17 (s, 3H); 1.10 (t, 3H)
II-87		C=O	CH ₃	Me	4-Br	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.89 (s, 1H); 7.12 (s, 2H); 3.93 (s, 3H); 3.40 (s, 2H); 3.29 (s, 3H); 2.17 (s, 6H)
II-88		C=O	CH ₃	Me	4-Br	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.89 (s, 1H); 7.13 (s, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.41 (s, 2H); 3.29 (s, 3H); 2.49 (m, 2H); 2.18 (s, 3H); 1.11 (t, 3H)
II-89		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Me	4-Br	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.90 (s, 1H); 7.13 (s, 2H); 6.08 (tt, 1H); 4.08 (td, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.45 (s, 2H); 2.16 (s, 6H)

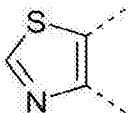
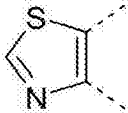
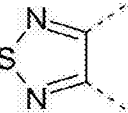
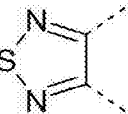
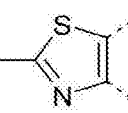
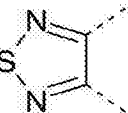
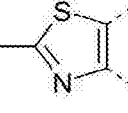
[0790]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-90		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.26 (m, 2H); 7.10 (t, 1H); 4.35 (q, 2H); 3.88 (s, 2H); 3.27 (s, 3H); 2.70 (s, 3H); 1.36 (t, 3H)
II-91		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Me	4-CF ₂ -CF ₃	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.89 (s, 1H); 7.19 (s, 2H); 6.08 (tt, 1H); 4.09 (td, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.56 (s, 2H); 2.25 (s, 6H)
II-92		C=O	CH ₃	I	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.90 (s, 1H); 7.65 (d, 1H); 7.15 (d, 1H); 3.94 (s, 3H); 3.68 (s, 2H); 3.32 (s, 3H); 2.61 (q, 2H); 1.15 (t, 3H)
II-93		C=O	CH ₂ -CHF ₂	I	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.92 (s, 1H); 7.65 (d, 1H); 7.16 (d, 1H); 6.08 (tt, 1H); 4.12 (td, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.72 (s, 2H); 2.61 (q, 2H); 1.15 (t, 3H)
II-94		C=O	CH ₂ -C≡CH	Me	4-CF ₂ -CF ₃	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.91 (s, 1H); 7.19 (s, 2H); 4.65 (d, 2H); 3.93 (s, 3H); 3.55 (s, 2H); 2.27 (s, 6H); 2.15 (br s, 1H)
II-95		C=O	CH ₃	Me	4-CF ₂ -CF ₃	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.87 (s, 1H); 7.18 (s, 2H); 3.93 (s, 3H); 3.52 (s, 2H); 3.31 (s, 3H); 2.27 (s, 6H)
II-96		C=O	CH ₂ -C≡CH	I	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.94 (s, 1H); 7.65 (d, 1H); 7.15 (d, 1H); 4.67 (d, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.71 (s, 2H); 2.62 (q, 2H); 2.14 (br s, 1H); 1.15 (t, 3H)
II-97		C=O	CH ₃	F	4-Me	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.81 (s, 1H); 6.73 (s, 1H); 6.59 (d, 1H); 3.89 (s, 3H); 3.51 (s, 2H); 3.28 (s, 3H); 2.24 (s, 3H); 2.20 (s, 3H)

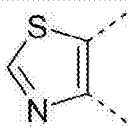
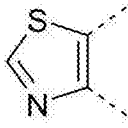
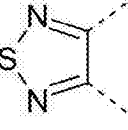
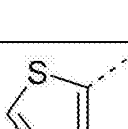
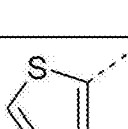
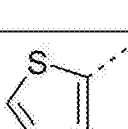
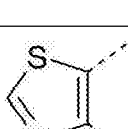
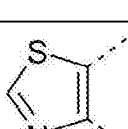
[0791]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-98		C=O	CH ₂ -CHF ₂	F	4-Me	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.81 (s, 1H); 6.74 (s, 1H); 6.60 (d, 1H); 6.09 (tt, 1H); 4.07 (td, 2H); 3.91 (s, 3H); 3.54 (s, 2H); 2.24 (s, 3H); 2.20 (s, 3H)
II-99		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Br	4-Br	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.89 (s, 1H); 7.54 (d, 1H); 7.26 (m, 1H); 6.08 (tt, 1H); 4.10 (td, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.68 (s, 2H); 2.28 (s, 3H)
II-100		C=O	CH ₃	Br	4-Br	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.88 (s, 1H); 7.52 (br s, 1H); 7.25 (d, 1H); 3.93 (s, 3H); 3.64 (s, 2H); 3.30 (s, 3H); 2.29 (s, 3H)
II-101		C=O	CH ₃	Br	4-Br	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.89 (s, 1H); 7.53 (m, 1H); 7.26 (m, 1H); 3.93 (s, 3H); 3.64 (s, 2H); 3.31 (s, 3H); 2.61 (q, 2H); 1.16 (s, 3H)
II-102		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Br	4-Br	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.91 (s, 1H); 7.53 (d, 1H); 7.27 (d, 1H); 6.08 (tt, 1H); 4.11 (td, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.67 (s, 2H); 2.60 (q, 2H); 1.16 (t, 3H)
II-103		C=O	CH ₂ -C≡CH	Br	4-Br	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.93 (s, 1H); 7.53 (d, 1H); 7.27 (d, 1H); 4.66 (d, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.66 (s, 2H); 2.61 (q, 2H); 2.14 (br s, 1H); 1.16 (t, 3H)
II-104		C=O	CH ₂ -C≡CH	Br	4-Br	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.92 (s, 1H); 7.51 (m, 1H); 7.25 (m, 1H); 4.65 (d, 2H); 3.93 (s, 3H); 3.66 (s, 2H); 2.29 (s, 3H); 2.15 (br s, 1H)

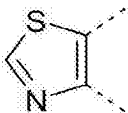
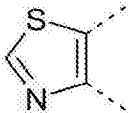
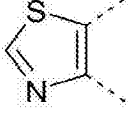
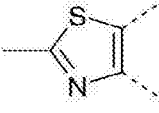
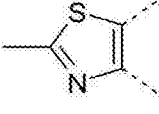
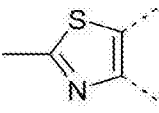
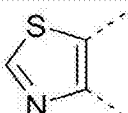
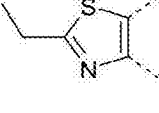
[0792]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-105		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Me	4-(2'-c-Pr)-c-Pr	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.88 (s, 1H); 6.64 (br s, 2H); 6.09 (br t, 1H); 4.07 (br t, 2H); 3.93 (s, 3H); 3.44 (s, 2H); 2.14 (s, 6H); 1.53 (m, 1H); 1.07 (m, 1H); 0.89 (m, 1H); 0.73 (m, 1H); 0.67 (m, 1H); 0.38 (m, 2H); 0.12 (m, 2H)
II-106		C=O	CH ₃	Me	4-(2'-c-Pr)-c-Pr	6-Me	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.86 (s, 1H); 6.63 (br s, 2H); 3.92 (s, 3H); 3.41 (br s, 2H); 3.28 (s, 3H); 2.15 (s, 6H); 1.53 (m, 1H); 1.07 (m, 1H); 0.89 (m, 1H); 0.73 (m, 1H); 0.66 (m, 1H); 0.38 (m, 2H); 0.12 (m, 2H)
II-107		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.30 (m, 2H); 7.16 (m, 1H); 4.29 - 3.27 (m, 8H)
II-108		C=O	CH ₃	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.42 (br s, 1H); 7.15 (br s, 1H); 4.11 - 3.26 (m, 8H); 2.63 (m, 2H); 1.21 (m, 3H)
II-109		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.26 (d, 2H); 7.11 (dd, 1H); 6.09 (tt, 1H); 4.07 (td, 2H); 3.91 (s, 3H); 3.90 (s, 2H); 2.70 (s, 3H)
II-110		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.40 (br s, 1H); 7.14 (br s, 1H); 6.07 (br t, 1H); 4.12 (m, 2H); 4.04 (s, 3H); 3.60 (s, 2H); 2.60 (q, 2H); 1.17 (t, 3H)
II-111		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.26 (d, 2H); 7.10 (t, 1H); 3.90 (s, 3H); 3.84 (s, 2H); 3.28 (s, 3H); 2.71 (s, 3H)

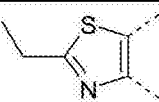
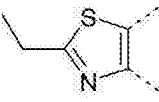
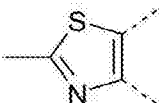
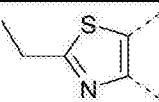
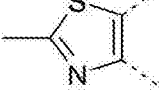
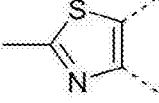
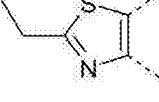
[0793]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-112		C=O	CH ₃	Br	4-Br	6-OCF ₃	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.87 (s, 1H); 7.65 (d, 1H); 7.35 (br s, 1H); 3.93 (s, 3H); 3.65 (s, 2H); 3.31 (s, 3H)
II-113		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Br	4-Br	6-OCF ₃	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.87 (s, 1H); 7.66 (d, 1H); 7.35 (m, 1H); 6.07 (tt, 1H); 4.10 (td, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.70 (s, 2H)
II-114		C=O	CH ₂ -C≡CH	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.41 (br s, 1H); 7.15 (br s, 1H); 4.70 (br s, 2H); 3.99 (br s, 3H); 3.61 (br s, 2H); 2.63 (m, 2H); 2.17 (br s, 1H); 1.19 (br s, 3H)
II-115		C=O	CH ₃	Cl	4-Br	6-OCF ₃	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.87 (s, 1H); 7.48 (d, 1H); 7.34 (d, 1H); 3.93 (s, 3H); 3.62 (s, 2H); 3.30 (s, 3H)
II-116		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	4-Br	6-OCF ₃	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.87 (s, 1H); 7.48 (d, 1H); 7.31 (m, 1H); 6.07 (tt, 1H); 4.09 (td, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.67 (s, 2H)
II-117		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Br	4-Cl	6-OCF ₃	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.88 (s, 1H); 7.51 (d, 1H); 7.22 (m, 1H); 6.08 (tt, 1H); 4.10 (td, 2H); 3.94 (s, 3H); 3.71 (s, 2H)
II-118		C=O	CH ₃	Br	4-Cl	6-OCF ₃	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.88 (s, 1H); 7.51 (d, 1H); 7.21 (br s, 1H); 3.93 (s, 3H); 3.66 (s, 2H); 3.31 (s, 3H)
II-119		C=O	CH ₂ -CHF ₂	F	6-CF ₃	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.93 (s, 1H); 7.44 (d, 1H); 7.37 (q, 1H); 7.26 (m, 1H); 6.07 (tt, 1H); 4.11 (td, 2H); 3.96 (s, 3H); 3.68 (s, 2H)

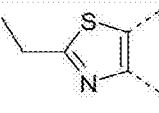
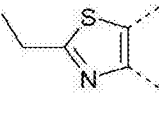
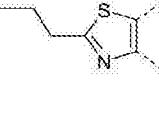
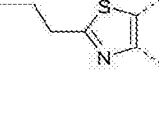
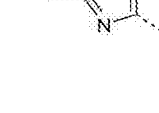
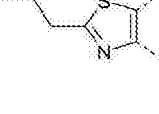
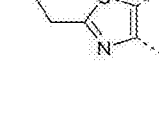
[0794]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-120		C=O	CH ₂ -C≡CH	F	6-CF ₃	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.95 (s, 1H); 7.43 (d, 1H); 7.35 (q, 1H); 7.25 (t, 1H); 4.65 (d, 2H); 3.95 (s, 3H); 3.65 (s, 2H); 2.14 (br s, 1H)
II-121		C=O	CH ₃	F	6-CF ₃	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.91 (s, 1H); 7.43 (d, 1H); 7.35 (q, 1H); 7.25 (t, 1H); 3.95 (s, 3H); 3.63 (s, 2H); 3.31 (s, 3H)
II-122		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	6-CF ₃	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.95 (s, 1H); 7.58 (dd, 2H); 7.33 (t, 1H); 6.07 (tt, 1H); 4.12 (td, 2H); 3.96 (s, 3H); 3.80 (s, 2H)
II-123		C=O	CH ₃	Cl	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.19 (d, 1H); 7.07 (d, 1H); 3.89 (s, 3H); 3.65 (s, 2H); 3.26 (s, 3H); 2.72 (s, 3H); 2.60 (q, 2H); 1.16 (t, 3H)
II-124		C=O	CH ₂ -C≡CH	Cl	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.19 (d, 1H); 7.08 (d, 1H); 4.61 (d, 1H); 3.89 (s, 3H); 3.68 (s, 2H); 2.75 (s, 3H); 2.60 (q, 2H); 2.14 (br s, 1H); 1.16 (t, 3H)
II-125		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.20 (d, 1H); 7.08 (d, 1H); 6.06 (tt, 1H); 4.06 (td, 2H); 3.90 (s, 3H); 3.69 (s, 2H); 2.73 (s, 3H); 2.58 (q, 2H); 1.16 (t, 3H)
II-126		C=O	CH ₃	Cl	6-CF ₃	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.93 (s, 1H); 7.57 (dd, 1H); 7.31 (t, 1H); 3.96 (s, 3H); 3.76 (s, 2H); 3.32 (s, 3H)
II-127		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.26 (m, 2H); 7.09 (t, 1H); 3.90 (s, 3H); 3.84 (s, 2H); 3.29 (s, 3H); 3.01 (q, 2H); 1.41 (t, 3H)

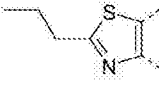
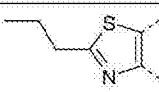
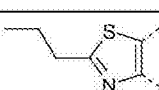
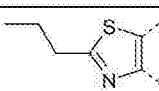
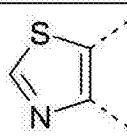
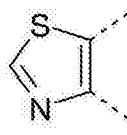
[0795]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-128		C=O	CH ₂ -C≡CH	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.26 (m, 2H); 7.10 (dd, 1H); 4.64 (d, 2H); 3.90 (s, 3H); 3.87 (s, 2H); 3.04 (q, 2H); 2.13 (br s, 1H); 1.42 (t, 3H)
II-129		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.20 (d, 1H); 7.08 (d, 1H); 6.06 (tt, 1H); 4.07 (td, 2H); 3.90 (s, 3H); 3.69 (s, 2H); 3.03 (q, 2H); 2.59 (q, 2H); 1.42 (t, 3H); 1.16 (t, 3H)
II-130		C=O	CH ₂ -C≡CH	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.38 (d, 1H); 7.12 (d, 1H); 4.62 (d, 2H); 3.89 (s, 3H); 3.72 (s, 2H); 2.75 (s, 3H); 2.61 (q, 2H); 2.14 (br s, 1H); 1.16 (t, 3H)
II-131		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.26 (m, 2H); 7.11 (dd, 1H); 6.09 (tt, 1H); 4.08 (td, 2H); 3.91 (s, 3H); 3.89 (s, 2H); 3.00 (q, 2H); 1.40 (t, 3H)
II-132		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.38 (d, 1H); 7.12 (d, 1H); 6.06 (tt, 1H); 4.07 (td, 2H); 3.90 (s, 3H); 3.73 (s, 2H); 2.74 (s, 3H); 2.60 (q, 2H); 1.16 (t, 3H)
II-133		C=O	CH ₃	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.38 (d, 1H); 7.11 (d, 1H); 3.89 (s, 3H); 3.69 (s, 2H); 3.27 (s, 3H); 2.73 (s, 3H); 2.61 (q, 2H); 1.16 (t, 3H)
II-134		C=O	CH ₃	Cl	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.19 (d, 1H); 7.07 (d, 1H); 3.89 (s, 3H); 3.65 (s, 2H); 3.27 (s, 3H); 3.02 (q, 2H); 2.60 (q, 2H); 1.42 (t, 3H); 1.16 (t, 3H)

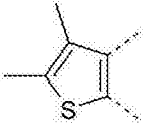
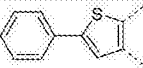
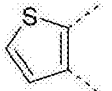
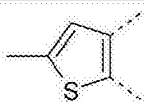
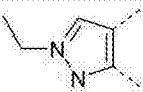
[0796]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-135		C=O	CH ₂ -C≡CH	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.38 (d, 1H); 7.12 (d, 1H); 4.63 (d, 2H); 3.90 (s, 3H); 3.71 (s, 2H); 3.05 (q, 2H); 2.62 (q, 2H); 2.13 (br s, 1H); 1.43 (t, 3H); 1.16 (t, 3H)
II-136		C=O	CH ₃	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.38 (d, 1H); 7.11 (d, 1H); 3.90 (s, 3H); 3.68 (s, 2H); 3.28 (s, 3H); 3.03 (q, 2H); 2.61 (q, 2H); 1.42 (t, 3H); 1.16 (t, 3H)
II-137		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.26 (m, 2H); 7.11 (dd, 1H); 6.09 (tt, 1H); 4.09 (td, 2H); 3.91 (s, 3H); 3.88 (s, 2H); 2.95 (t, 2H); 1.83 (sxt, 2H); 1.04 (t, 3H)
II-138		C=O	CH ₃	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.26 (m, 2H); 7.10 (dd, 1H); 3.90 (s, 3H); 3.83 (s, 2H); 3.29 (s, 3H); 2.96 (t, 2H); 1.85 (sxt, 2H); 1.05 (t, 3H)
II-139		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.20 (d, 1H); 7.08 (d, 1H); 6.06 (tt, 1H); 4.07 (td, 2H); 3.90 (s, 3H); 3.68 (s, 2H); 2.97 (t, 2H); 2.59 (q, 2H); 1.85 (sxt, 2H); 1.16 (t, 3H); 1.04 (t, 3H)
II-140		C=O	CH ₂ -C≡CH	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.26 (m, 2H); 7.10 (dd, 1H); 4.64 (d, 2H); 3.90 (s, 3H); 3.86 (s, 2H); 2.98 (t, 2H); 2.12 (br s, 1H); 1.85 (sxt, 2H); 1.04 (t, 3H)
II-141		C=O	CH ₂ -C≡CH	Cl	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.19 (d, 1H); 7.07 (d, 1H); 4.63 (d, 2H); 3.89 (s, 3H); 3.67 (s, 2H); 2.99 (t, 2H); 2.60 (q, 2H); 2.12 (br s, 1H); 1.86

[0797]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
								(sxt, 2H); 1.16 (t, 3H); 1.04 (t, 3H)
II-142		C=O	CH ₃	BrI	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.38 (d, 1H); 7.11 (d, 1H); 3.90 (s, 3H); 3.67 (s, 2H); 3.28 (s, 3H); 2.97 (t, 2H); 2.61 (q, 2H); 1.85 (sxt, 2H); 1.16 (t, 3H); 1.05 (t, 3H)
II-143		C=O	CH ₃	Cl	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.19 (d, 1H); 7.07 (d, 1H); 3.89 (s, 3H); 3.64 (s, 2H); 3.27 (s, 3H); 2.96 (t, 2H); 2.60 (q, 2H); 1.85 (sxt, 2H); 1.16 (t, 3H); 1.05 (t, 3H)
II-144		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.39 (d, 1H); 7.13 (d, 1H); 6.06 (tt, 1H); 4.08 (td, 2H); 3.90 (s, 3H); 3.72 (s, 2H); 2.98 (t, 2H); 2.60 (q, 2H); 1.85 (sxt, 2H); 1.16 (t, 3H); 1.05 (t, 3H)
II-145		C=O	CH ₂ -C≡CH	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.38 (d, 1H); 7.12 (d, 1H); 4.64 (d, 2H); 3.90 (s, 3H); 3.71 (s, 2H); 2.99 (t, 2H); 2.61 (q, 2H); 2.12 (br s, 1H); 1.84 (sxt, 2H); 1.16 (t, 3H); 1.04 (t, 3H)
II-146		C=O	CH ₂ -CH ₂ -S CH ₃	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.87 (s, 1H), 7.26 (d, 2H), 7.11 (t, 1H), 3.95 (m, 5H), 3.79 (s, 2H), 2.76 (t, 2H), 2.11 (s, 3H)
II-147		C=O	CH ₂ -CH ₂ -O CH ₃	Cl	6-Cl	H	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 8.85 (s, 1H), 7.26 (d, 2H), 7.10 (t, 1H), 4.00 (t, 2H), 3.97 (s, 3H), 3.82 (s, 2H), 3.60 (t, 2H), 3.21 (s, 3H)

[0798]

编号	A	V	W	X	Y	Z	R ⁹	分析数据
II-148		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	4-Br	6-Et	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.37 (d, 1H); 7.23 (d, 1H); 6.05 (tt, 1H); 4.33 (m, 2H); 4.18 (m, 1H); 3.73 (s, 2H); 3.69 (m, 1H); 2.54 (q, 2H); 2.37 (s, 3H); 2.30 (s, 3H); 1.36 (t, 3H); 1.17 (t, 3H)
II-149		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.64 (m, 2H); 7.45 (m, 3H); 7.39 (d, 1H); 7.27 (s, 1H); 7.12 (d, 1H); 6.14 (br tt, 1H); 4.37 (m, 3H); 3.71 (br s, 2H); 3.66 (m, 1H); 2.59 (q, 2H); 1.40 (t, 3H); 1.17 (t, 3H)
II-150		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Cl	4-Br	6-Et	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.62 (d, 1H); 7.36 (d, 1H); 7.24 (d, 1H); 7.11 (d, 1H); 6.09 (br tt, 1H); 4.25 (m, 1H); 3.92 (s, 3H); 3.63 (m, 1H); 3.55 (d, 2H); 2.55 (q, 2H); 1.16 (t, 3H)
II-151		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	Me	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.41 (d, 1H); 7.13 (d, 1H); 7.09 (q, 1H); 6.07 (tt, 1H); 4.15 (m, 1H); 3.87 (s, 3H); 3.76 (m, 3H); 2.56 (q, 2H); 2.49 (d, 3H); 1.16 (t, 3H)
II-152		C=O	CH ₂ -CHF ₂	Br	4-Cl	6-Et	Et	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃): 7.98 (s, 1H); 7.39 (d, 1H); 7.12 (d, 1H); 6.06 (tt, 1H); 4.30 (q, 2H); 4.20 (q, 2H); 4.03 (m, 2H); 3.68 (m, 2H); 2.58 (q, 2H); 1.55 (t, 3H); 1.35 (t, 3H); 1.14 (t, 3H)

[0799] 前体的说明性制备：

[0800] 13. 4-[(2,2-二氟乙基)[(2-碘苄基)磺酰基]氨基]-1,3-噻唑-5-羧酸甲酯的制备：

[0801] 将 2.1g (4.8mmol) 4-[(2-碘苄基)磺酰基]氨基]-1,3-噻唑-5-羧酸甲酯溶于

20ml 乙腈中,RT 下加入 0.9ml (5.3mmol)N,N-二异丙基乙基胺。反应混合物在 RT 下搅拌 5 分钟,然后在 10 分钟内逐滴加入 1.54g (7.2mmol) 三氟甲磺酸二氟乙基酯的 5ml 乙腈溶液。将反应混合物在 RT 下搅拌 12 小时然后浓缩至干燥。通过制备 HPLC(C₁₈-SiO₂,梯度乙腈/水 20 : 80 至 100 : 0) 的方式纯化剩余物。这样得到 2.09g 4-[(2,2-二氟乙基)[(2-碘苄基)磺酰基]氨基]-1,3-噻唑-5-羧酸甲酯。

[0802] ¹H NMR(400MHz, CDCl₃) :8.82(s, 1H) ;7.90(br d, 1H) ;7.63(dd, 1H) ;7.35(td, 1H) ;7.04(td, 1H) ;5.96(tt, 1H) ;4.81(s, 2H) ;4.14(td, 1H) ;3.92(s, 3H)。

[0803] 14.4-[(2-碘苄基)磺酰基]氨基]-1,3-噻唑-5-羧酸甲酯的制备:

[0804] 将 2g (12.64mmol) 4-氨基-1,3-噻唑-5-羧酸甲酯与 5.1ml (63.2mmol) NEt₃ 一起溶于 20ml 二氧杂环己烷中,室温下加入 4.4g (13.9mmol) (2-碘苄基)甲磺酰氯。反应混合物在 RT 下搅拌 5 小时。然后加入 40ml 水并且混合物用乙酸乙酯反复萃取。将合并的有机相用 2N HCl 洗涤,干燥并且浓缩。通过柱色谱(SiO₂,梯度乙酸乙酯/正庚烷 10 : 90 至 75 : 25) 的方式纯化剩余物。这样得到 4.3g 4-[(2-碘苄基)磺酰基]氨基]-1,3-噻唑-5-羧酸甲酯。

[0805] ¹H NMR(400MHz, CDCl₃) :9.01(br s, 1H) ;8.81(s, 1H) ;7.87(d, 1H) ;7.51(d, 1H) ;7.36(t, 1H) ;7.04(td, 1H) ;5.06(s, 2H) ;3.88(s, 3H)。

[0806] B. 制剂实施例

[0807] 1. 粉末剂

[0808] 粉末剂通过以下方式获得:使 10 重量份式(I) 化合物与 90 重量份作为惰性物质的滑石混合并将混合物在锤磨机中粉碎。

[0809] 2. 可分散粉剂

[0810] 易分散于水中的可湿性粉剂通过以下方式获得:使 25 重量份式(I) 化合物、64 重量份作为惰性物质的含高岭土的石英、10 重量份木素磺酸钾与 1 重量份作为湿润剂和分散剂的油酰基甲基牛磺酸钠混合,并将混合物在销-盘式研磨机(pinned-disk mill) 中研磨。

[0811] 3. 分散浓缩剂

[0812] 易分散于水中的分散浓缩剂通过以下方式获得:使 20 重量份式(I) 化合物与 6 重量份烷基酚聚乙二醇醚(® Triton X207)、3 重量份异十三烷醇聚乙二醇醚(8E0) 和 71 重量份石蜡矿物油(沸程例如约 255 至大于 277℃) 混合,并将混合物在球磨机中研磨至细度低于 5 微米。

[0813] 4. 乳油

[0814] 乳油由以下物质获得:15 重量份式(I) 化合物、75 重量份作为溶剂的环己酮和 10 重量份作为乳化剂的氧乙基化壬基酚。

[0815] 5. 水分散性颗粒剂

[0816] 水分散性颗粒剂通过以下方式获得:

[0817] 将以下物质混合:

[0818] 75 重量份式(I) 化合物、

[0819] 10 重量份木质素磺酸钙、

[0820] 5 重量份十二烷基硫酸钠、

[0821] 3 重量份聚乙烯醇和

[0822] 7 重量份高岭土,

[0823] 将混合物在销-盘式研磨机中研磨,并将粉末在流化床中通过喷雾作为制粒液体的水而粒化。

[0824] 水分散性颗粒剂还通过以下方式获得:

[0825] 将以下物质在胶体磨中进行均化和预粉碎:

[0826] 25 重量份式 (I) 化合物、

[0827] 5 重量份 2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸钠、

[0828] 2 重量份油酰基甲基牛磺酸钠、

[0829] 1 重量份聚乙烯醇、

[0830] 17 重量份碳酸钙和

[0831] 50 重量份水,

[0832] 然后将混合物在砂磨机中研磨,并将所得悬浮液在喷雾塔中用单物质喷嘴雾化和干燥。

[0833] C. 生物学实施例

[0834] 1. 对杂草植物的苗前除草作用以及与作物植物的相容性

[0835] 将单子叶或双子叶杂草植物的种子或根茎部分置于直径为 9-13cm 盆中的砂壤土中,并用土覆盖。然后将配制为乳油或粉末剂形式的除草剂,以水性分散液或悬浮液或乳液的形式以 300 至 800l/ha(经换算的)的水施用率施用于覆盖土的表面。随后,将盆置于温室中,并使之保持处于对于植物的进一步栽培而言的最优条件下。测试植物在温室中在最优生长条件下 3-4 周后,目测评价本发明化合物的效果。例如,编号为 Ia-26、I-c-4、I-a-9、I-a-8、I-a-66、I-g-5、I-a-90、I-a-96 和 I-b-13 的化合物在 1280g/ha 的施用率下各自对阿拉伯婆婆纳 (*Veronica persica*) 表现出至少 80% 的活性。编号为 I-a-13、I-a-65、I-a-74 和 I-b-14 的化合物在 1280g/ha 的施用率下各自对 *Echinoa crus galli*、多花黑麦草 (*Lolium multiflorum*) 和狗尾草 (*Setaria viridis*) 表现出至少 80% 的活性。编号为 I-a-75、I-a-89、I-a-94、I-a-97 和 I-c-38 的化合物在 320g/ha 的施用率下各自对繁缕 (*Stellaria media*) 和阿拉伯婆婆纳 (*Veronica persica*) 表现出至少 80% 的活性,并且同时不表现出对玉米的伤害。编号为 I-a-2、I-a-28 和 I-a-43 的化合物在 320g/ha 的施用率下各自对狗尾草 (*Setaria viridis*) 表现出至少 80% 的活性,并且同时不表现出对油菜的伤害。编号为 I-a-36、I-b-22 和 I-a-44 的化合物在 320g/ha 的施用率下各自对多花黑麦草 (*Lolium multiflorum*) 表现出至少 80% 的活性,并且同时不表现出对玉米的伤害。

[0836] 2. 对杂草植物的苗后除草活性以及与作物植物的相容性

[0837] 将单子叶或双子叶杂草植物的种子置于纸板盆中的砂壤土中,用土覆盖,并使之于温室中良好生长条件下培育。播种后 2 至 3 周,在三叶期处理所述测试植株。然后将配制为可湿性粉剂或乳油形式的本发明化合物,以 600 至 800L/ha(经换算的)的水施用率喷洒到植物绿色部位的表面上。将所述测试植株于温室中在最优生长条件下放置约 3-4 周之后,目测评价本发明化合物的效果。例如,编号为 Ia-26、I-a-38 和 I-b-1 的化合物在 1280g/ha 的施用率下各自对反枝苋 (*Amaranthus retroflexus*)、多花黑麦草 (*Lolium multiflorum*) 和繁缕 (*Stellaria media*) 表现出至少 80% 的活性。

[0838] 编号为 I-a-26、I-a-9、I-a-75、I-a-88、I-a-89、I-a-94、I-a-8 和 I-b-13 的化合物在 1280g/ha 的施用率下各自对无臭母菊 (*Matricaria inodora*) 和卷茎蓼 (*Fallopia convolvulus*) 表现出至少 80% 的活性。编号为 I-g-5、I-h-11、I-a-83、I-a-86 和 I-a-93 的化合物在 320g/ha 的施用率下各自对繁缕 (*Stellaria media*) 和阿拉伯婆婆纳 (*Veronica persica*) 表现出至少 80% 的活性, 并且同时不表现出对玉米的伤害。编号为 I-a-36、I-a-37 和 I-a-44 的化合物在 320g/ha 的施用率下各自对无臭母菊 (*Matricaria inodora*)、卷茎蓼 (*Fallopia convolvulus*)、繁缕 (*Stellaria media*) 和阿拉伯婆婆纳 (*Veronica persica*) 表现出至少 80% 的活性, 并且同时不表现出对玉米的伤害。