(19)国家知识产权局

(12)发明专利申请

(10)申请公布号 CN 119546584 A
(43)申请公布日 2025.02.28

(21)申请号 202380039322.4
(22)申请日 2023.05.10
(30)优先权数据
202211027227 2022.05.11 IN
(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2024.11.08
(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/IN2023/050445 2023.05.10
(87)PCT国际申请的公布数据
WO2023/218484 EN 2023.11.16
(71)申请人 PI工业有限公司
地址 印度拉贾斯坦邦
(72)发明人 阿贾伊·辛格·亚达夫
阿米特·库马尔·杜塔
希瓦·纳根德拉·库马尔·莫塔波图拉
巴格万·拉伊·古尔贾尔
普利泰斯·拉梅什·杰恩
罗怀特·萨辛那
萨钦·哈利拉·帕乔乐
拉维库马尔·瑟亚纳拉亚纳·萨拉古
亚历山大·G·M·克劳泽纳
(74)专利代理机构 北京金信知识产权代理有限公司 11225
专利代理师 徐琳 严彩霞
(51)Int.Cl.
C07D 401/04(2006.01)
A01N 43/56(2006.01)
A01N 43/90(2006.01)
A01P 7/04(2006.01)
C07D 401/14(2006.01)
C07D 471/04(2006.01)

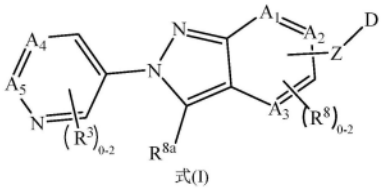
权利要求书6页 说明书161页

(54)发明名称

双环化合物及其作为害虫控制剂的用途

(57)摘要

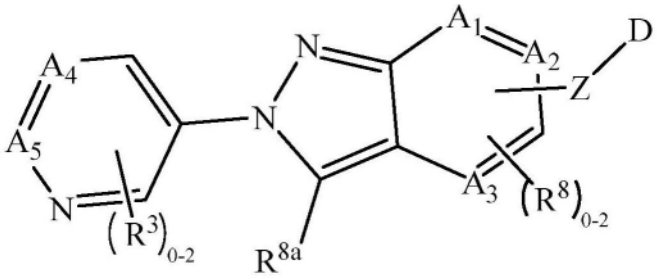
本发明提供一种新颖的式(I)的双环化合物,其中,A_1、A_2、A_3、A_4、A_5、Z、D、R^3、R^8以及R^{8a}的定义如详细说明所描述。其展现高杀虫效率。本发明也涉及一种式(I)化合物的制备方法。本发明还涉及式(I)化合物的组成物、组合、用途以及应用方法。



式(I)

CN 119546584 A

1.一种式(I)化合物,

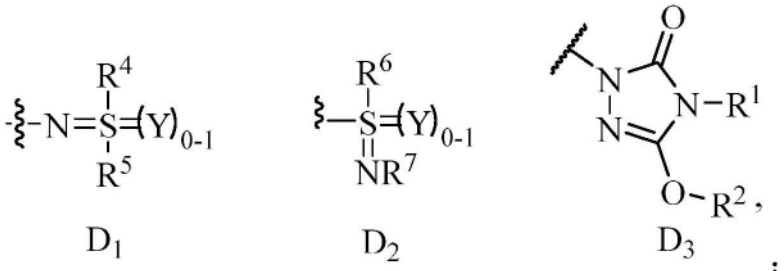


式(I)

其中,

Z选自直接键或-C(=O)-;

D选自由D_1、D_2以及D_3所组成的群组,



D_1　　D_2　　D_3;

Y代表O或NR^7;

A_1、A_2以及A_3独立地为C或N;

A_4以及A_5独立地为C或N,前提是A_4与A_5不能同时为N;

R^1选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、苯基、苯甲基、苯乙基以及C_2-C_6杂环基;

R^2选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基以及C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基;

R^3选自由以下所组成的群组:氢、卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_3-C_6环烷基、C_1-C_6烷氧基以及C_1-C_6卤烷基;

R^4选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基以及-NR^cR^d;

R^c选自由以下所组成的群组:氢、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基以及C_3-C_8环烷基;

R^d选自由以下所组成的群组:氢、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_6环烷基-C_1-C_4烷基;

或者

R^c以及R^d取代基与其连接的原子或与其他原子可一起形成3至6员的环,该其他原子选自由以下所组成的群组:C、N、O、C(=O)、C(=S)以及$S(O)_{0-2}$,该环可选择性地被一或多个选自由以下所组成的群组的取代基取代:卤素、CN以及C_1-C_6烷基;

R^5选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6卤烯基、苯基、苯甲基以及C_2-C_6杂环基;

或者

R^4以及R^5取代基与其连接的原子或与其他原子可一起形成3至6员的环,该其他原子选自由以下所组成的群组:C、N、O、C(=O)、C(=S)以及$S(O)_{0-2}$,该环可选择地被一或多个选自由以下所组成的群组的取代基取代:卤素、CN以及C_1-C_6烷基;

R^6选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、苯基、苯甲基、C_2-C_6杂环基以及-NR^cR^d;

R^7选自由以下所组成的群组:氢、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_1-C_6烷氧基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、苯基、苯甲基、C_2-C_6杂环基、C_2-C_6杂环基-C_1-C_6烷基、-COR^5、-$CONR^cR^d$、SCF_3以及-SO_2R^5;

R^8以及R^{8a}独立地选自由以下所组成的群组:氢、卤素、腈基、C_1-C_4烷基、C_1-C_4卤烷基;

R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6以及R^7的各脂肪族基团可选择性地被R^a的一或多个基团取代;以及R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6以及R^7的环基团可选择地被R^b的一或多个基团取代,其中,

R^a选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷硫基、苯基以及C_2-C_6杂环基;

R^b选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷硫基、C_1-C_6卤烷硫基、C_1-C_6烷氧基以及C_1-C_6卤烷氧基;

或其盐、立体异构物、互变异构物、多晶型物、金属配合物或N-氧化物。

2.如权利要求1所述的式(I)化合物,其中D为D_1。

3.如权利要求1所述的式(I)化合物,其中D为D_2。

4.如权利要求1所述的式(I)化合物,其中D为D_3。

5.如权利要求1至4所述的式(I)化合物,其中Z为一直接键。

6.如权利要求1所述的式(I)化合物,其中,D为D_1;

Z为直接键或-C(=O)-;

R^3选自由以下所组成的群组:氢、卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基以及C_1-C_6烷氧基;

R^4选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基以及-NR^cR^d;

其中,R^c选自以下所组成的群组:氢或C_1-C_6烷基;

R^d选自以下所组成的群组:氢或C_1-C_6烷基;

R^5选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、苯基、苯甲基以及C_2-C_6杂环基;

或者

R^4以及R^5取代基与其连接的原子或与其他原子可一起形成4至6员的环,该其他原子选自由以下所组成的群组:C、N、O、C(=O)、C(=S)以及$S(O)_{0-2}$,该环可选择性地被一或多个选自由以下所组成的群组的取代基取代:卤素、CN以及C_1-C_6烷基;

其中,R^5、R^6以及R^7的各脂肪族基团可选择性地被R^a的一或多个基团取代,且R^4以及

R^5的环基团可选择地被R^b的一或多个基团取代,

R^a选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷硫基、苯基以及C_2-C_6杂环基;

R^b选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷

基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷硫基、C_1-C_6卤烷硫基、C_1-C_6烷氧基以及C_1-C_6卤烷氧基;

R^8以及R^{8a}独立地选自由以下所组成的群组:氢、卤素、腈基、C_1-C_4烷基以及C_1-C_4卤烷基;

A_1、A_2、A_3、A_4以及A_5如权利要求1所定义;

或其盐、立体异构物、互变异构物、多晶型物、金属配合物或N-氧化物。

7.如权利要求1所述的式(I)化合物,其中D为D_2;Z为一直接键;

R^3选自由以下所组成的群组:氢、卤素、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基以及C_1-C_6烷氧基;

R^6选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基以及-NR^cR^d;

其中,R^c选自以下所组成的群组:氢或C_1-C_6烷基;

R^d选自以下所组成的群组:氢或C_1-C_6烷基;

R^7选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、-COR^5、苯基、苯甲基、C_2-C_6杂环基以及腈基;

其中,R^5选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基以及C_3-C_8环烷基;

其中,R^5、R^6以及R^7的各脂肪族基团可选择性地被R^a的一或多个基团取代,且R^5、R^6以及R^7的环基团可选择地被R^b的一或多个基团取代,

R^a选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷硫基、苯基以及C_2-C_6杂环基;

R^b选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷硫基、C_1-C_6卤烷硫基、C_1-C_6烷氧基以及C_1-C_6卤烷氧基;

R^8以及R^{8a}独立地选自由以下所组成的群组:氢、卤素、腈基、C_1-C_4烷基以及C_1-C_4卤烷基;

A_1、A_2、A_3、A_4以及A_5如权利要求1所定义;

或其盐、立体异构物、互变异构物、多晶型物、金属配合物或N-氧化物。

8.如权利要求1所述的式(I)化合物,其中D为D_3;Z为一直接键;

R^1选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_6环烷基、C_3-C_6环烷基-C_1-C_6烷基、苯基、苯甲基、苯乙基以及C_2-C_6杂环基;

其中,R^1的各脂肪族基团可选择性地被R^a的一或多个基团取代,且R^1的环基团可选择地被R^b的一或多个基团取代,

R^a选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷硫基、苯基以及C_2-C_6杂环基;

R^b选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷硫基、C_1-C_6卤烷硫基、C_1-C_6烷氧基以及C_1-C_6卤烷氧基;

R^2为C_1-C_6烷基;

R^3选自由以下所组成的群组:氢、卤素、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基以及C_1-C_6烷氧基;

R^8以及R^{8a}独立地选自由以下所组成的群组:氢、卤素、腈基、C_1-C_4烷基以及C_1-C_4卤烷基;

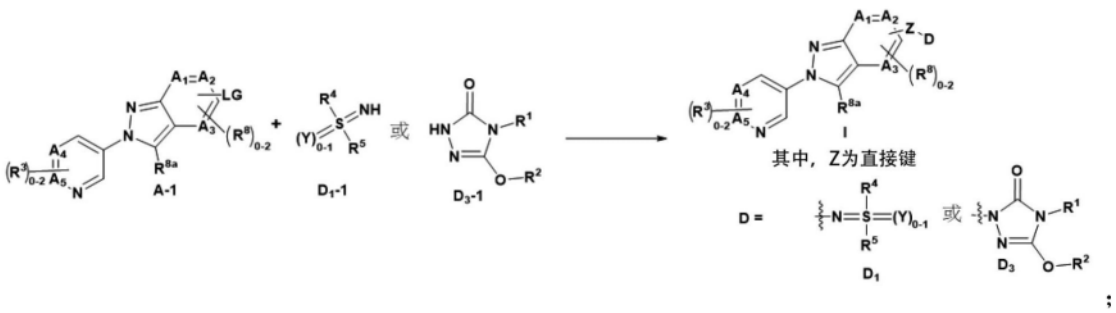
A_1、A_2、A_3、A_4以及A_5如权利要求1所定义;

或其盐、立体异构物、互变异构物、多晶型物、金属配合物或N-氧化物。

9.如权利要求6或7或8所述的式(I)化合物,其中A_1、A_2、A_3、A_4以及A_5独立地为C;或者A_1、A_2、A_3以及A_5独立地为C,且A_4为N;或者A_1、A_2、A_4以及A_5独立地为C,且A_3为N;或者A_1、A_2以及A_5独立地为C,且A_3以及A_4独立地为N;或者A_2、A_3、A_4以及A_5独立地为C且A_1为N;或者A_2、A_3以及A_5独立地为C,且A_1以及A_4独立地为N;或者A_5为N且A_1、A_2、A_3以及A_4独立地为C;或者A_2为N且A_1、A_3、A_4以及A_5独立地为C;或者A_2以及A_4独立地为N且A_1、A_3以及A_5独立地为C。

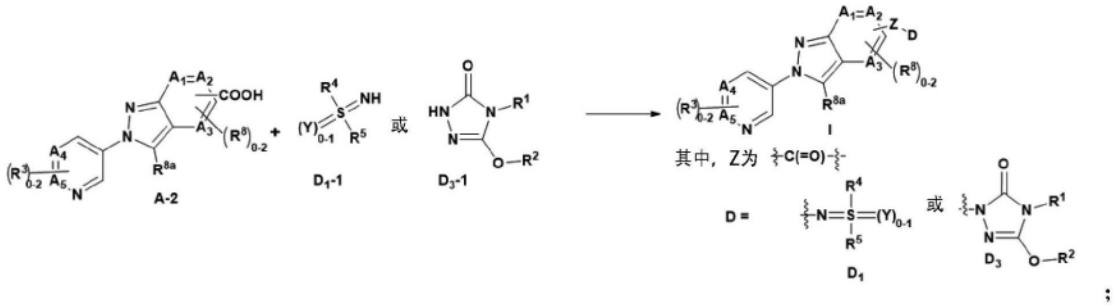
10.一种如权利要求1所述的其中D为D_1或D_3的式(I)化合物或其盐、金属配合物、立体异构物、多晶型物或N-氧化物的制备方法,包括步骤:

i.以一式(D_1-1)或(D_3-1)化合物与一式(A-1)化合物反应而得到其中Z为一直接键的一式(I)化合物;



或者

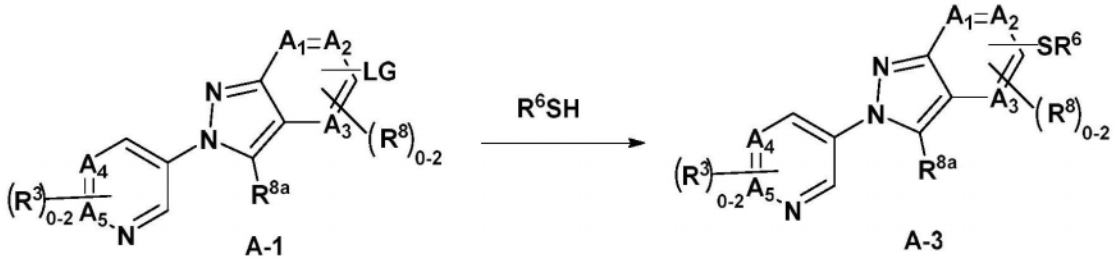
i.以一式(D_1-1)或(D_3-1)化合物与一式(A-1)化合物反应而得到其中Z为—-C(=O)-键的一式(I)化合物;



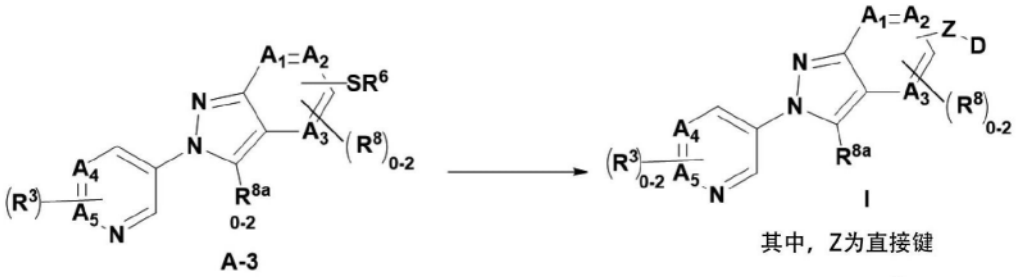
其中,LG代表一离去基且A_1、A_2、A_3、A_4、A_5、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^8以及R^{8a}的定义与权利要求1相同。

11.一种如权利要求1所述的其中D为D_2的式(I)化合物或其盐、金属配合物、立体异构物、多晶型物或N-氧化物的制备方法,包括步骤:

i.以一式R^6SH化合物与一式(A-1)化合物反应而得到其中Z为一直接键的一式(A-3)化合物;



ii.利用合适的氧化剂以及氮来源通过(O)以及(N)转移将该式(A-3)化合物转换为一式(I)化合物而得到该式(I)化合物,



;

其中，A_1、A_2、A_3、A_4、A_5、R^3、R^6、R^7、R^8以及R^{8a}的定义与权利要求1相同。

12.一种组成物，包括如权利要求1所述的该式(I)化合物或其盐、金属配合物、立体异构物、多晶型物或N-氧化物以及至少一额外成分，该额外成分选自由以下所组成的群组：界面活性剂以及助剂。

13.如权利要求12所述的组成物，其中该组成物额外包括至少一生物活性兼容化合物，选自杀真菌剂、杀虫剂、杀线虫剂、杀螨剂、生物农药、除草剂、植物生长调节剂、生物刺激素、抗生素、肥料或营养素。

14.如权利要求12所述的组成物，其中，该式(I)化合物的存在量以重量计占组成物总重量的0.1％至99％。

15.一种组合物，包括一生物有效量的如权利要求1所述的式(I)化合物以及至少一额外的生物活性兼容化合物，选自杀真菌剂、杀虫剂、杀线虫剂、杀螨剂、生物杀虫剂、除草剂、植物生长调节剂、生物刺激素、抗生素、肥料及营养剂。

16.一种防治昆虫及螨类害虫的方法，包括：使昆虫及螨类害虫、其栖息地、繁殖地、食物供应处、植物、种子、土壤、区域、材料或昆虫及螨类害虫正在生长或可能生长的环境，或被保护免于害虫侵袭或侵染的材料、植物、种子、土壤、表面或空间与如权利要求1所述的式(I)化合物或其盐、立体异构物、多晶型物、金属配合物、N-氧化物，如权利要求12所述的组成物或如权利要求15所述的组合物进行接触。

17.一种保护作物免于受到昆虫及螨类害虫侵扰的方法，包括：使作物与如权利要求1所述的式(I)化合物或其盐、立体异构物、多晶型物、金属配合物、N-氧化物，或与如权利要求12所述的组成物或与如权利要求15所述的组合物进行接触。

18.如权利要求16或17所述的方法，其中该方法包括：将有效剂量的该式(I)化合物施加在农业或园艺作物中，该有效剂量为1克有效成分(gai)至5000克有效成分每公顷。

19.一种保护种子、植物及植物部分免受土壤昆虫以及保护幼苗根及芽免受土壤及叶面昆虫侵害的方法，包括：在播种前及/或预发芽后，使该些种子与如权利要求1所述的式(I)化合物或其盐、立体异构物、多晶型物、金属配合物、N-氧化物，或如权利要求12所述的组成物或如权利要求15所述的组合物进行接触。

20.一种如权利要求1所述的式(I)化合物或其盐、立体异构物、多晶型物、金属配合物、N-氧化物，或如权利要求12所述的组成物或如权利要求15所述的组合物的用途，其是用于防治农作物、园艺作物中的昆虫及螨虫害虫、家庭及媒介控制及动物寄生虫。

21.如权利要求20所述的式(I)化合物的用途，其中该农作物为谷物、玉米、高粱、珍珠

小米(bajra)、大米、大豆、油料种子及其他豆科植物、水果及果树、葡萄、坚果及坚果树、柑橘及柑橘树、任何园艺植物、葫芦科植物、含油植物、烟草、咖啡、茶、可可、糖用甜菜、糖用甘蔗、棉花、马铃薯、西红柿、洋葱、辣椒、其他蔬菜及观赏植物。

22.一种种子,包括如权利要求1所述的式(I)化合物或其盐、立体异构物、多晶型物、金属配合物、N-氧化物,或如权利要求12所述的组成物或如权利要求15所述的组合物,其中该种子中的该式(I)化合物的量以重量计为0.0001%至1%。

双环化合物及其作为害虫控制剂的用途

技术领域

[0001] 此处所述的本发明涉及新颖的双环化合物,尤其地,本发明涉及式(I)化合物、包含该化合物的组成物及其做为害虫控制剂的用途。进一步地,本发明也涉及这些新颖的双环化合物及其有用的中间产物的制备。

现有技术

[0002] 由现有技术,例如PCT专利公开号WO2018011111、PCT专利公开号WO2016071499、PCT专利公开号WO2015038503、PCT专利公开号WO2016087363、PCT专利公开号WO2016087368、PCT专利公开号WO2016087421以及PCT专利公开号WO2016087422已知,特定的经取代双环化合物表现害虫控制性质。

[0003] 上述现有技术中所提到的活性化合物在某些方面有缺点。例如,它们只表现出狭窄的杀虫活性谱,在较低的施用率下没有令人满意的害虫控制效果,或者没有表现出所需的快速作用或持久的活性。

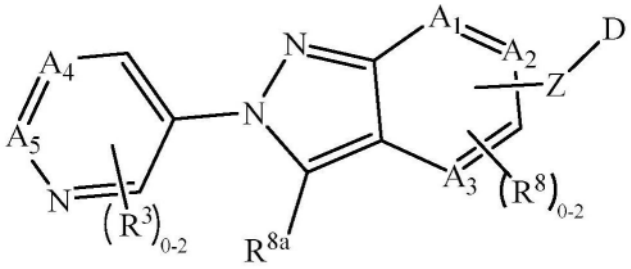
[0004] 因此,不断需要有新的害虫控制剂,其杀虫活性提高、药效范围更广、活性更持久、植物兼容性更强、环境安全性更高、配方性能更好、抗性发展风险更低。

发明内容

[0005] 本发明涉及新颖的双环化合物,这些化合物被发现比文献中报导的类似化合物具有有利的效果,无论是在改善害虫控制活性、更有利的生物或环境特性、更广泛的应用范围或增强植物兼容性方面。

[0006] 本发明的新颖双环化合物也可与其他生物活性化合物结合使用,通过这种方式提高药效,特别是对难以控制的昆虫。

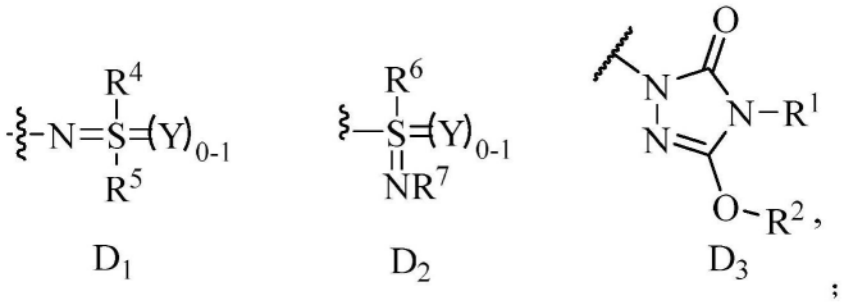
[0007] 因此,本发明提供一种新颖的式(I)的双环化合物,

[0008] 

[0009] 其中,

[0010] Z选自直接键(direct bond)或-C(=O)-;

[0011] D选自由D_1、D_2以及D_3所组成的群组,

[0012] 

D1 D2 D3 ;

[0013] Y代表O或NR^7;

[0014] A_1、A_2以及A_3独立地为C或N;

[0015] A_4以及A_5独立地为C或N,前提是A_4与A_5不能同时为N;

[0016] R^1选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、苯基、苯甲基、苯乙基以及C_2-C_6杂环基;

[0017] R^2选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基以及C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基;

[0018] R^3选自由以下所组成的群组:氢、卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_3-C_6环烷基、C_1-C_6烷氧基以及C_1-C_6卤烷基;

[0019] R^4选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基以及-NR^cR^d;

[0020] R^c选自由以下所组成的群组:氢、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基以及C_3-C_8环烷基;

[0021] R^d选自由以下所组成的群组:氢、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_6环烷基-C_1-C_4烷基;

[0022] 或者

[0023] R^c以及R^d取代基与其连接的原子或与其他原子可一起形成3至6员的环,该其他原子选自由以下所组成的群组:C、N、O、C(=O)、C(=S)以及$S(O)_{0-2}$,该环可选择性地被一或多个选自由以下所组成的群组的取代基取代:卤素、CN以及C_1-C_6烷基;

[0024] R^5选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6卤烯基、苯基、苯甲基以及C_2-C_6杂环基;

[0025] 或者

[0026] R^4以及R^5取代基与其连接的原子或与其他原子可一起形成3至6员的环,该其他原子选自由以下所组成的群组:C、N、O、C(=O)、C(=S)以及$S(O)_{0-2}$,该环可选择地被一或多个选自由以下所组成的群组的取代基取代:卤素、CN以及C_1-C_6烷基;

[0027] R^6选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、苯基、苯甲基、C_2-C_6杂环基以及-NR^cR^d;

[0028] R^7选自由以下所组成的群组:氢、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_1-C_6烷氧基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、苯基、苯甲基、C_2-C_6杂环基、C_2-C_6杂环基-C_1-C_6烷基、-COR^5、-$CONR^cR^d$、SCF_3以及-SO_2R^5;

[0029] R^8以及R^{8a}独立地选自由以下所组成的群组:氢、卤素、腈基、C_1-C_4烷基以及C_1-C_4卤烷基;

[0030] 其中,R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6以及R^7的各脂肪族基团可选择性地被R^a的一或多个基团取

代;以及R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6以及R^7的环基团可选择地被R^b的一或多个基团取代,其中,

[0031] R^a选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷硫基、苯基以及C_2-C_6杂环基;

[0032] R^b选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷硫基、C_1-C_6卤烷硫基、C_1-C_6烷氧基以及C_1-C_6卤烷氧基;

[0033] 或其盐、立体异构物、互变异构物、多晶型物、金属配合物或N-氧化物。

[0034] 在另一实施例中,本发明提供一种组成物,包括该式(I)化合物或其盐、金属配合物、立体异构物、多晶型物或N-氧化物以及至少一额外成分,该额外成分选自由以下所组成的群组:界面活性剂以及助剂。

[0035] 在又一实施例中,本发明提供一种组成物,其中该组成物额外包括至少一生物活性兼容化合物,选自杀真菌剂、杀虫剂、杀线虫剂、杀螨剂、生物农药、除草剂、植物生长调节剂、生物刺激素、抗生素、肥料或营养素。

[0036] 在又一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物的制备方法。

[0037] 本发明将于以下详细描述。

[0038] 实施方式

[0039] 定义:

[0040] 此处为本说明书中使用的用语提供的定义仅用于说明目的,并且不以任何方式限制本说明书中公开的本发明的范围。

[0041] 如此处所使用,用语“包括”(comprises,comprising,includes,including)、“具有”(has,having)、“包含”(contains,containing)、“其特征在于”(characterized by)或其任何其他变形,是用以涵盖非排他性的包含,但需遵守明确指出的任何限制。举例来说,包括元素列表(a list of elements)的组成物、混合物、制程或方法不一定只限于这些元素,还可能包括该组成物、混合物、制程或方法没有明确列出或者所固有的其他元素。

[0042] 连接词“由…组成”(consisting of)排除任何未指明的组件、步骤或成分。如果出现在权利要求中,则将使权利要求不能包含除了所述材料以外的其他材料,除非是通常与之相关的杂质。当“由...组成”这一词组出现在一权利要求的主体(body)的某一句子中,而不是紧跟在前言(preamble)之后时,它只限制该句子中规定的组件;其他组件并没有被排除在整个权利要求之外。

[0043] 连接词词组“基本上由…组成”(consisting essentially of)是用于定义一种组成物或方法,其中所包括的材料、步骤、特征、成分或元素,除了文义上公开的以外,这些额外的材料、步骤、特征、成分或元素不会实质地影响所请求保护的发明的基本及新颖特征。用语“基本上由...组成”占据了“包括”与“由...组成”的中间位置。

[0044] 此外,除非有明确的相反说明,否则“或”指的是包容性的“或”而非排他性的“或”。例如,一个条件A“或”B是由以下任何一种情况满足的:A是真(或存在),B是假(或不存在),A是假(或不存在),B是真(或存在),以及A及B都是真(或存在)。

[0045] 同样地,在本发明的组件或组件之前的不定冠词“一”(a及an)是为了不限制该元素或组件的实例(即发生次数)。因此,“一”(a或an)应被理解为包括一个或至少一个,并且元素或组件的单数词形式也包括复数,除非该数字显然是指单数。

[0046] 如本说明书内容所述,用语“无脊椎动物害虫”(invertebrate pest)或“无脊椎动物”(invertebrates)包括具有经济重要性的节肢动物、腹足动物及线虫等害虫。用语“节肢动物”(arthropod)包括昆虫、螨虫、蜘蛛、蝎子、蜈蚣、千足虫、球潮虫及多足类。用语“腹足动物”(gastropod)包括蜗牛、蛞蝓及其他柄眼目动物(Stylommatophora)。用语“线虫”(nematode)是指线虫门(Phylum Nematoda)的活生物体。用语“蠕虫”(helminths)包括蛔虫、心丝虫、植食性线虫(Nematoda)、吸虫(Tematoda)、棘头虫(acanthocephala)以及绦虫(Cestoda)。

[0047] 在本说明书的上下文中,“无脊椎动物害虫控制”(invertebrate pest control)是指抑制无脊椎动物害虫发育(包括死亡率、摄食减少及/或交配中断),并且相关用语被类似地予以定义。

[0048] 用语“农艺学”(agronomic)是指田间作物的生产,例如用于食品、饲料及纤维,以及包括玉米、大豆及其他豆类、稻米、谷物(例如小麦、燕麦、大麦、黑麦、稻米、玉米)、叶类蔬菜(例如莴苣、卷心菜及其他油菜作物)、果类蔬菜(例如西红柿、胡椒、茄子、十字花科植物及葫芦科植物)、马铃薯、地瓜、葡萄、棉花、树果(例如梨果、核果及柑橘)、小水果(浆果、樱桃)以及其他特色作物(例如油菜、向日葵、橄榄)的生长。

[0049] 用语“非农艺学”(non-agronomic)是指农作物以外的作物,例如园艺作物(例如,不是在田间种植的温室、苗圃或是观赏植物)、住宅、农业、商业及工业结构、草皮(例如草皮农场、牧场、高尔夫球场、草坪、运动场等)、木制品、储存产品、农林业及植被管理、公共卫生(即人类)及动物健康(例如,驯养动物(如宠物、家畜及家禽)以及未驯化的动物(如野生动物)的应用。

[0050] 非农艺学应用包括藉由向要保护的动物施用杀寄生虫有效(即生物学有效)量的本公开化合物,通常以配制用于兽医用途的组成物的形式,保护动物免受无脊椎动物寄生害虫的侵害。如本案说明书及权利要求中所提及的,用语“杀寄生虫的”(parasiticidal)及“杀寄生虫地”(parasiticidally)是指对无脊椎寄生害虫提供保护动物免受害虫侵害的可观察效果。杀寄生虫效果通常涉及减少目标无脊椎寄生害虫的发生或活动。对害虫的此类影响包括死亡、生长迟缓、活动性减弱或在宿主动物体内或体内停留的能力减弱、进食减少及繁殖受到抑制。这些对无脊椎动物寄生虫害虫的影响提供了对动物寄生虫感染或感染的控制(包括预防、减少或消除)。

[0051] 本公开的化合物可以纯物质或作为不同可能的异构物形式或作为光学异构物存在,异构物例如立体异构物,举例来说,外消旋混合物、单独的立体异构物或结构异构物的混合物。各种立体异构物包括镜像异构物、非镜像异构物、掌性异构物、阻转异构物、构形异构物、互变异构物、光学异构物、多晶型物以及几何异构物。这些异构物的任何所需混合物都落入本文的申请专利范围内。所属技术领域中具有通常知识者将理解,当一立体异构物相对于其他异构物浓缩(enriched)或当其与其他异构物分离时,可能更具活性及/或可能表现出有益效果。此外,所属技术领域中具有通常知识者知道分离、浓缩及/或选择性地制备所述异构物的过程或方法或技术。

[0052] 现在将对说明书中各种用语的定义予以说明。

[0053] 用语“烷基”(alykl),不管单独使用或是以复合词型态使用(例如“烷硫基”(alkylthio)或“卤烷基”(haloalkyl)或-N(烷基)或烷基羰基烷基或烷基磺酰胺基,包括直

链或支链的C_1至C_{12}烷基,较佳为C_1至C_8烷基,更佳为C_1至C_6烷基。烷基的代表实例包括但不限于甲基、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、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基及1-乙基-2-甲基丙基或不同的异构物。如果烷基在复合取代基的末端,例如在烷基环烷基中,则复合取代基的起始部分,例如环烷基,可以被烷基相同或不同地且独立地单取代或多取代。这同样也适用于复合取代基,其中其他基团,例如烯基、炔基、羟基、卤素、羰基、羰氧基等位于末端。

[0054] 用语“烯基”(alkenyl),不管单独使用或是以复合词型态使用,包括直链或支链的C_2-C_{12}烯烃,更佳为C_2-C_8烯烃,最佳为C_2-C_6烯烃。烯烃的代表性实例包括乙烯基、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、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-丙烯基及1-乙基-2-甲基-2-丙烯基及不同的异构物。“烯基”还包括多烯,例如1,2-丙二烯基及2,4-己二烯基。除非在别处具体定义,否则此定义也适用于作为复合取代基的一部分的烯基,例如烯基等。

[0055] 炔烃的非限制性粒子包括乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、3-甲基-1-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、1-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-1-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、4-甲基-1-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基以及1-乙基-1-甲基-2-丙炔基以及不同的异构物。除非在别处特别定义,否则此定义也适用于作为复合取代基的一部分的炔基,例如炔基等。用语“炔基”(alkynyl)还可包括由多个三键组成的部分,例如2,5-己二炔基。

[0056] 用语“环烷基”(cycloalkyl)是指闭合以形成环的烷基。非限制性的实例包括环丙基、环丁基、环戊基、环己基以及环庚基。除非在别处特别定义,否则此定义也适用于作为复合取代基的一部分的环烷基,例如环烷基烷基等。

[0057] 用语“环烷氧基”(cycloalkoxy)、“环烯氧基”(cycloalkenyloxy)等用语定义类似。环烷氧基的非限制性实例包括环丙氧基、环戊氧基以及环己氧基。除非在别处特别定义,否则此定义也适用于作为复合取代基的一部分的环烷氧基,例如环烷氧基烷基等。

[0058] 用语“卤素”(halogen),不管是单独使用或是以复合词型态使用(例如“卤烷基”(haloalkyl)),包括氟、氯、溴或碘。此外,当用于复合词如“卤烷基”时,所述烷基可以部分或全部被卤素原子取代,卤素原子可以相同或不同。“卤烷基”的非限制性实例包括氯甲基、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、1,1-二氯-2,2,2-三氟乙基以及1,1,1-三氟丙-2-基。除非在别处具体定义,否则此定义也适用于作为复合取代基的一部分的卤烷基,例如卤烷基胺基烷基等。

[0059] 用语“卤烯基”(haloalkenyl)、“卤炔基”(haloalkynyl)的定义类似,不同之处在于烯基及炔基作为取代基的一部分存在而不是烷基。

[0060] 用语“卤烷氧基”(haloalkoxy)是指直链或支链烷氧基,其中这些基团中的一些或全部氢原子可以被上述卤原子取代。卤烷氧基的非限制性实例包括氯甲氧基、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、五氟乙氧基以及1,1,1-三氟丙-2-氧基。除非在别处具体定义,否则此定义也适用于作为复合取代基的一部分的卤烷氧基,例如卤烷氧基烷基等。

[0061] 用语“卤烷硫基”(haloalkylthio)是指直链或支链烷硫基,其中这些基团中的一些或全部氢原子可以被上述卤原子取代。卤烷硫基的非限制性实例包括氯甲硫基、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、2-二氟乙硫基、2-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、五氟乙硫基以及1,1,1-三氟丙-2-硫基。除非在别处具体定义,否则此定义也适用于作为复合取代基的一部分的卤烷硫基,例如卤烷硫基烷基等。

[0062] 用语“羟基”(hydroxy)是指-OH,胺基是指-NRR,其中R可以是H或者任何可能的取代基,例如烷基。羰基是指-C(O)-,羰氧基是指-OC(O)-,亚磺酰基是指SO,磺酰基是指$S(O)_2$。

[0063] 用语“烷氧基”(alkoxy),不管是单独使用或是以复合词型态使用,包括C_1至C_{12}烷氧基,较佳为C_1至C_8烷氧基,更佳为C_1至C_6烷氧基。烷氧基的实例包括甲氧基、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-甲基丙氧基以及1-乙基-2-甲基丙氧基以及不同的异构物。除非在别处具体定义,否则此定义也适用于作为复合取代基的一部分的烷氧基,例如卤烷氧基、炔基烷氧基等。

[0064] 用语“烷氧基烷基”(Alkoxyalkyl)表示烷基上的烷氧基取代。“烷氧基烷基”的非限制性的实例包括CH_3OCH_2、$CH_3OCH_2CH_2$、$CH_3CH_2OCH_2$、$CH_3CH_2CH_2CH_2OCH_2$以及$CH_3CH_2OCH_2CH_2$。

[0065] 用语“烷硫基”(alkylthio)包括支链或直链烷硫基的基团,例如甲硫基、乙硫基、丙硫基、1-甲乙硫基、丁硫基、1-甲丙硫基、2-甲丙硫基、1,1-二甲乙硫基、戊硫基、1-甲乙硫基、2-甲丁硫基、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-甲基丙硫基以及1-乙基-2-甲基丙硫基等不同的异构物。

[0066] 卤环烷基、卤环烯基、烷基环烷基、环烷基烷基、环烷氧基烷基、烷基亚磺酰基烷基、烷基磺酰基烷基、卤烷基羰基、环烷基羰基、卤烷氧基烷基等的定义与上述实例类似。

[0067] “烷基胺基”(Alkylamino)、“二烷基胺基”(dialkylamino)等的定义与上述实例类似。

[0068] 用语“碳环”(carbocycle)包括“芳香碳环系统”及“非芳香碳环系统”或多环或双环(螺、稠合、桥接、非稠合)环化合物,其中环可以是芳香或非芳香的(其中芳香表示满足休克尔(Huckel)规则,非芳香表示不满足休克尔规则)。

[0069] 与环相关的用语“杂”(hetero)是指至少一个环原子不是碳并且可包含1至4个独立地选自由氮、氧及硫所组成的群组的杂原子的环,假设每个环包含不超过4个氮、不超过2个氧及不超过2个硫。

[0070] 用语“杂环”(heterocycle或heterocyclic)包括“芳香杂环”或“杂芳环系统”以及“非芳香杂环系统”或多环或双环(螺、稠合、桥接、非稠合)环化合物,其中环可以是芳香的或非芳香的,其中杂环含有至少一个选自N、O、S(O)$_{0-2}$的杂原子,及/或杂环的碳环成员可以被C(=O)、C(=S)、C(=CR*R*)及C=NR*取代,*表示整数。

[0071] 用语“非芳香杂环”(non-aromatic heterocycle)或“非芳香杂环的”(non-aromatic heterocyclic)是指三至十五员,较佳为三至十员的饱和或部分不饱和的杂环,该杂环包含一至四个杂原子,选自氧、氮及硫所组成的群组,是单环、双环或三环,其除了碳环员以外,还包含一至三个氮原子及/或一个氧原子或硫原子或一或二个氧原子及/或硫原子;若还含有超过一个的氧原子,其非直接邻接;例如(但不限于)氧杂环丁基(oxetanyl)、环氧乙烷基(oxiranyl)、氮丙啶基(aziridinyl)、噻吩基(thietanyl)、四氢呋喃基(tetrahydrofuranyl)、四氢噻吩基(tetrahydrothienyl)、吡咯啶基(pyrrolidinyl)、异恶唑啶基(isoxazolidinyl)、异噻唑啉基(isothiazolidinyl)、吡唑啶基(pyrazolidinyl)、恶唑啶基(oxazolidinyl)、噻唑啶基(thiazolidinyl)、咪唑啶基(imidazolidinyl)、1,2,4-恶二唑啶基、1,2,4-噻二唑啶基、1,2,4-三唑啶-1-基、1,2,4-三唑啶-3-基、1,2,3-三唑啶基、1,3,4-恶二唑啶基、1,3,4-噻二唑啶基、1,3,4-三唑啶基、二氢呋喃基(dihydrofuryl)、二氢噻吩基(dihydrothienyl)、吡咯啉基(pyrrolinyl)、异恶唑啉基(isoxazolinyl)、异噻唑啉基(isothiazolinyl)、二氢吡唑基(dihydropyrazolyl)、二氢恶唑基(dihydrooxazolyl)、二氢噻唑基(dihydrothiazolyl)、哌啶基(piperidinyl)、吡嗪基(pyrazynyl)、吗啉基(morpholinyl)、硫吗啉基(thiomorphlinyl)、1,3-二恶-5-基、四氢吡喃基(tetrahydropyranyl)、四氢噻吩基(tetrahydrothienyl)、六氢哒嗪基(hexahydropyridazinyl)、六氢嘧啶基(hexahydropyrimidinyl)、哌嗪基(piperazinyl)以及环丝胺酸。除非在别处具体定义,否则此定义也适用于作为复合取代基的一部分的杂环基,例如杂环基烷基等。

[0072] 用语“杂芳基”(heteroaryl)或“芳族杂环”(aromatic hetercyclic)是指含有1至4个选自O、N及S的杂原子的五或六员、完全不饱和的单环系统;如果环含有1个以上的氧原

子,则它们不直接相邻;含有1至4个氮原子或1至3个氮原子及1个硫或氧原子的五员杂芳基:五员杂芳基,除碳原子外,还可含有1到4个氮原子或1到3个氮原子及1个硫或氧原子做为环成员。例如,但不限于:呋喃基(furyl)、噻吩基(thienyl)、吡咯基(pyrrolyl)、异恶唑基(isoxazolyl)、异噻唑基(isothiazolyl)、吡唑基(pyrazolyl)、恶唑基(oxazolyl)、噻唑基(thiazolyl)、咪唑基(imidazolyl)、1,2,4-恶二唑基(oxadiazolyl)、1,2,4-噻二唑基(thiadiazolyl)、1,2,4-三唑基(triazolyl)、1,3,4-恶二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,3,4-三唑基、四唑基(tetrazolyl);含有1到4个氮原子的氮键合五员杂芳基,或含有1到3个氮原子的苯并稠合氮键合五员杂芳基:五员杂芳基,除碳原子外,还可含有1到4个氮原子或1到3个氮原子做为环成员,其中两个相邻的碳环成员或一个氮及一个相邻的碳环成员可以被丁-1,3-二烯-1,4-二基的基团桥连,其中1个或2个碳原子可以被氮原子取代,其中这些环通过氮环成员之一连接到主链上,例如,但不限于:1-吡咯基、1-吡唑基、1,2,4-三唑-1-基、1-咪唑基、1,2,3-三唑-1-基以及1,3,4-三唑-1-基。

[0073] 含有1到4个氮原子的六员杂芳基:除碳原子外,还可分别含有1到3个及1到4个氮原子作为环成员的六员杂芳基,非限制性实例:吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、吡嗪基、1,3,5-三嗪-2-基、1,2,4-三嗪-3-基以及1,2,4,5-四嗪-3-基;含有1到3个氮原子或1个氮原子及1个氧或硫原子的苯并稠合五员杂芳基:非限制性实例为吲哚基(indolyl)、苯并咪唑基(benzimidazolyl)、吲唑基(indazolyl)、苯并呋喃基(benzofuranyl)、苯并噻吩基(benzothiophenyl)、苯并噻唑基(benzothiazolyl)以及苯并恶唑基(benzoxazolyl);含有1到3个氮原子的苯并稠合六员杂芳基,非限制性实例:喹啉基(quinolinyl)、异喹啉基(isoquinolinyl)、喹喔啉基(quinoxalinyl)、酞嗪基(phthalazinyl)、喹唑啉基(quinazolinyl)及肉桂基(cinnolinyl)。

[0074] 用语“部分/完全饱和或未饱和杂环”(partially/fully saturated or unsaturated heterocycles)包含部分/完全饱和的杂环以及部分/完全未饱和的杂环。

[0075] 除非在别处具体定义,否则此定义也适用于作为复合取代基的一部分的杂芳基,例如杂芳基烷基等。

[0076] “烷基羰基”(alkylcarbonyl)的非限制性实例包括C(O)CH_3、C(O)$CH_2CH_2CH_3$以及C(O)$CH(CH_3)_2$。“烷氧基羰基”(alkoxycarbonyl)的非限制性实例包括CH_3OC(=O)、CH_3CH_2OC(=O)、$CH_3CH_2CH_2OC$(=O)、$(CH_3)_2CHOC$(=O)以及不同的丁氧基-或戊氧基羰基的异构物。

[0077] 用语“酰胺”(amide)是指A-R’C=ONR”-B,其中R’以及R”代表取代基,A及B代表任何基团。

[0078] 用语“硫酰胺”(thioamide)是指A-R’C=SNR”-B,其中R’以及R”代表取代基,A及B代表任何基团。

[0079] 取代基中的碳原子总数由前缀“C_i-C_j”表示,其中i及j是1至18的数字。例如,C_1-C_3烷基磺酰基表示甲磺酰基到丙磺酰基;C_2烷氧基烷基表示CH_3OCH_2;C_3烷氧基烷基表示例如$CH_3CH(OCH_3)$、$CH_3OCH_2CH_2$或$CH_3CH_2OCH_2$;C_4烷氧基烷基是指被总共包含4个碳原子的烷氧基取代的烷基的各种异构物,实例包括$CH_3CH_2CH_2OCH_2$以及$CH_3CH_2OCH_2CH_2$。在以上叙述中,当式(I)化合物由一个或多个杂环组成时,所有取代基通过任何可用的碳或氮通过取代所述碳或氮上的氢而连接至这些环。

[0080] 当化合物被带有下目标取代基取代时,且所述取代基指示所述取代基的数目可以

超过1时,则所述取代基(当它们超过1时)独立地选自被定义的取代基组。此外,当$(R)_m$中的下标$_m$表示范围从例如0到4的整数时,则取代基的数目可以选自0到4之间的整数,包括0及4。

[0081] 当一个基团包含一个可以是氢的取代基时,那么,当该取代基被视为氢时,则认为该基团是未取代的。

[0082] 此处所使用的用语“可选择地经取代”(optionally substituted)是与用语“经取代或未经取代”(substituted or unsubstituted)或用语“(未)经取代”((un)substituted)交换使用。除非他处有指示,一可选择地经取代的基团可以在该基团的各可取代位置具有一取代基,且各取代是彼此独立的。一可选择地经取代的基团也可以没有取代基。因此,用语“可选择地以一或多个取代基取代”(optionally substituted with one or more substituents)是指取代基的数量可以从零至可用的取代数量不等。

[0083] 用语(未)经取代是指该基团为未经取代或者该基团是独立地被选自由以下所组成的群组取代:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷氧基、NH(烷基)、N(烷基)$_2$以及-S(O)$_{0-2}$$C_1$-$C_6$烷基。

[0084] 用语“脂肪族基团”(aliphatic group),不管是单独使用或是以复合词型态使用,包含直链或支链取代基,例如C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_1-C_6烷硫基、C_1-C_6卤烷硫基、C_1-C_6烷氧基或者C_1-C_6卤烷氧基;

[0085] 用语“环基团”(cyclic groups),不管是单独使用或者以复合词型态使用,包含完全/部分饱和或未饱和环取代基或基团,例如环烷基、苯基、C_2-C_6杂环基等。

[0086] 参考说明书中的非限制性实施例来解释本文中的实施例及其各种特征与有利细节。省略对众所周知的组件及处理技术的描述,以免不必要地混淆此处的实施例。此处使用的示例仅旨在促进对可实践此处实施例的方式的理解并进一步使所属技术领域中具有通常知识者能够实践此处实施例。因此,这些示例不应被解释为限制本文实施例的范围。

[0087] 对具体实施例的描述将充分揭示这里的实施例的一般性质,其他人可以通过应用现有的知识,在不偏离一般概念的情况下,很容易地修改及/或改编为各种应用的具体实施例,因此,这种改编及修改应该并打算在所公开的实施例的文义及均等范围内被理解。应该理解的是,这里采用的措辞或用语是为了描述而不是限制。因此,虽然这里的实施例是以较佳实施例来描述的,但所属技术领域中具有通常知识者将认识到,这里的实施例可以在其所描述的实施例的精神及范围内进行修改后实施。

[0088] 说明书中对文件、行为、材料、装置、物品等的任何讨论都只是为了给本案提供一个背景。它不应被视为承认任何或所有这些事项构成现有技术基础的一部分,或在本案的优先权日期之前任何地方存在的与本案有关的领域中的一般知识。

[0089] 说明书及说明书/权利要求中提到的数值虽然可能构成本发明的关键部分,但对这些数值的任何偏离仍应属于本发明的范围,如果该偏离遵循与本发明中公开的相同的科学原理。如果合适,本发明的化合物可以不同可能的异构形式的混合物存在,尤其是立体异构物,例如E及Z、苏式(threo)及赤式(erythro),以及光学异构物。但如果合适的话还有互变异构物。E与Z异构物、苏式与赤式异构物及光学异构物以及可能的互变异构形式的任何所需混合物都被公开并请求保护。。

[0090] 用于本文的目的的用语“害虫”(pest)包括但不限于真菌、原生藻菌

(stramenopiles)(卵菌纲(oomycetes))、细菌、线虫、螨虫、蜱、昆虫及啮齿动物。

[0091] 用语“植物”(plant)在此被理解为指所有植物及植物种群,例如期望及不期望的野生植物或作物植物(包括天然存在的作物植物)。作物植物可以是可以通过常规育种及优化方法或通过生物技术及基因工程方法或这些方法的组合获得的植物,包括基因转殖植物,包括受植物育种者的权利保护及不受保护的植物栽培品种。

[0092] 在本公开中,用语“植物”包括以树木、灌木、草本植物、草、蕨类植物及苔藓为例的种类的活生物体,它们通常生长在一个地点,通过其根部吸收水分及所需物质,并且通过光合作用在其叶子中合成养分。

[0093] 用于本发明目的的“植物”的例子包括但不限于农作物(如小麦、黑麦、大麦、黑小麦、燕麦或稻米);甜菜(如糖用甜菜或饲料甜菜);水果及果树(如梨果、核果或软果(如苹果、梨子、李子、桃子、杏仁、樱桃、草莓、覆盆子、黑莓或醋栗));豆科植物(如扁豆、豌豆、苜蓿或大豆);油料植物(如油菜、芥末、橄榄、向日葵、椰子、可可豆、蓖麻油植物、油棕、花生或大豆);葫芦科植物(如南瓜、黄瓜或甜瓜);纤维植物(如棉花、亚麻、大麻或黄麻);柑橘类水果及柑橘树(如柳橙、柠檬、葡萄柚或橘子);任何园艺植物;蔬菜(如菠菜、生菜、芦笋、高丽菜、胡萝卜、洋葱、蕃茄、马铃薯、葫芦科或辣椒);月桂科植物(如酪梨、肉桂或樟脑);葫芦科植物;含油植物;能源及原物料植物(如谷物、玉米、大豆、其他豆科植物、油菜、甘蔗或油棕);烟草;坚果;咖啡;茶;可可;香蕉;胡椒;葡萄藤(食用用葡萄及葡萄汁用葡萄);啤酒花(hop);草皮;甜叶(也称为甜叶菊);天然橡胶植物或观赏及林业植物(如花卉、灌木、阔叶树或常绿植物(如针叶树));以及植物繁殖材料(如种子)及这些植物的作物材料。

[0094] 较佳地,用于本发明目的的植物包括但不限于谷类、玉米、稻米、大豆及其他豆科植物、水果及果树、葡萄、坚果及坚果树、柑橘及柑橘树、任何园艺植物、葫芦科植物、含油植物、烟草、咖啡、茶、可可、糖用甜菜、甘蔗、棉花、马铃薯、蕃茄、洋葱、胡椒及蔬菜、观赏植物、任何花卉植物及其他供人类及动物使用的植物。

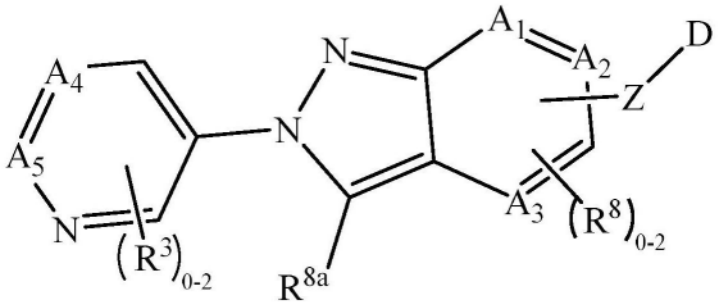
[0095] 用语“植物部分”(plant parts)应理解为表示地上及地下植物的所有部分及器官。出于本公开的目的,用语植物部分包括但不限于插条、叶、枝条、块茎、花、种子、分枝、根(包括主根、侧根、根毛、根尖、根冠、根状茎)、枝、嫩部(shoots)、果实、子实体、树皮、茎、芽、辅助芽、分生组织、节以及节间。

[0096] 用语“其所在地”(locus thereof)包括土壤、植物或者植物部分的周遭以及播种/种植植物或植物部分之前、期间或之后所使用的设备或工具。

[0097] 将本案的化合物或是在本案的化合物任选包含其他兼容化合物的组成物中施用于植物或植物材料或其所在地,包括藉由本案所属技术领域中具有通常知识者已知的技术施用,包括但不限于喷洒、涂抹(coating)、浸置(dipping)、熏蒸(fumigating)、浸渍(impregnating)、注射以及喷粉(dusting)。

[0098] 用语“施用”(applied)是指以物理或化学(包括浸渍)的方式贴附到植物或植物部分上。

[0099] 本发明涉及一种如式(I)所示的化合物,

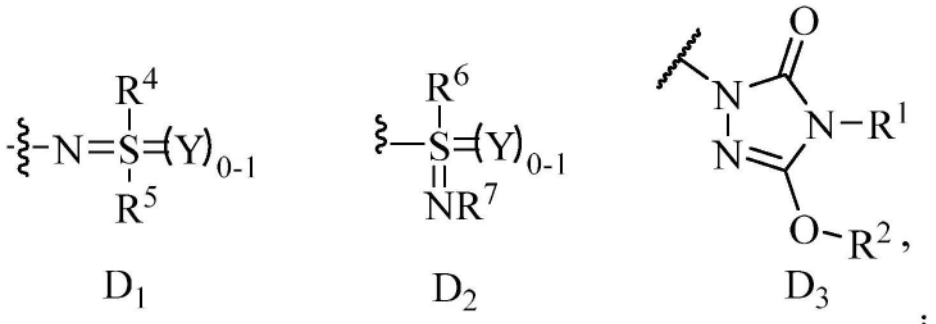
[0100] 

式(I)

[0101] 其中,

[0102] Z选自直接键(direct bond)或-C(=O)-;

[0103] D选自由D_1、D_2以及D_3所组成的群组,

[0104] 

D_1 D_2 D_3 ;

[0105] Y代表O或NR^7;

[0106] A_1、A_2以及A_3独立地为C或N;

[0107] A_4以及A_5独立地为C或N,前提是A_4与A_5不能同时为N;

[0108] R^1选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、苯基、苯甲基、苯乙基以及C_2-C_6杂环基;

[0109] R^2选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基以及C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基;

[0110] R^3选自由以下所组成的群组:氢、卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_3-C_6环烷基、C_1-C_6烷氧基以及C_1-C_6卤烷基;

[0111] R^4选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基以及-NR^cR^d;

[0112] R^c选自由以下所组成的群组:氢、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基以及C_3-C_8环烷基;

[0113] R^d选自由以下所组成的群组:氢、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_6环烷基-C_1-C_4烷基;

[0114] 或者

[0115] R^c以及R^d取代基与其连接的原子或与其他原子可一起形成3至6员的环,该其他原子选自由以下所组成的群组:C、N、O、C(=O)、C(=S)以及$S(O)_{0-2}$,该环可选择性地被一或多个选自由以下所组成的群组的取代基取代:卤素、CN以及C_1-C_6烷基;

[0116] R^5选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6卤烯基、苯基、苯甲基以及C_2-C_6杂环基;或者

[0117] R^4以及R^5取代基与其连接的原子或与其他原子可一起形成3至6员的环,该其他原子选自由以下所组成的群组:C、N、O、C(=O)、C(=S)以及$S(O)_{0-2}$,该环可选择地被一或多个选自由以下所组成的群组的取代基取代:卤素、CN以及C_1-C_6烷基;

[0118] R^6选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、苯基、苯甲基、C_2-C_6杂环基以及$-NR^cR^d$;

[0119] R^7选自由以下所组成的群组:氢、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_1-C_6烷氧基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、苯基、苯甲基、C_2-C_6杂环基、C_2-C_6杂环基-C_1-C_6烷基、$-COR^5$、$-CONR^cR^d$、SCF_3以及$-SO_2R^5$;

[0120] R^8以及R^{8a}独立地选自由以下所组成的群组:氢、卤素、腈基、C_1-C_4烷基以及C_1-C_4卤烷基;其中,R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6以及R^7的各脂肪族基团可选择性地被R^a的一或多个基团取代;以及R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6以及R^7的环基团可选择地被R^b的一或多个基团取代,其中,

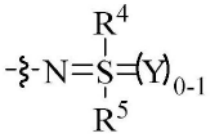
[0121] R^a选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷硫基、苯基以及C_2-C_6杂环基;

[0122] R^b选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷硫基、C_1-C_6卤烷硫基、C_1-C_6烷氧基以及C_1-C_6卤烷氧基;

[0123] 或其盐、立体异构物、互变异构物、多晶型物、金属配合物或N-氧化物。

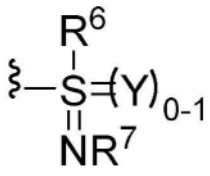
[0124] 以下实施例提供了关于根据本发明的式(I)化合物的取代基的定义,包括较佳的定义。对于这些取代基中的任何一个,以下给出的任何定义可以与以下或本文件其他地方给出的任何其他取代基的任何定义组合。

[0125] 在一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中D为D_1,

[0126]  Z、Y、R^3、R^4以及R^5如上所定义。

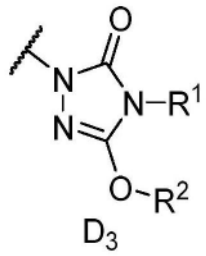
D_1 ;

[0127] 在另一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中D为D_2,

[0128]  Z为直接键,Y、R^3、R^6以及R^7如上所定义。

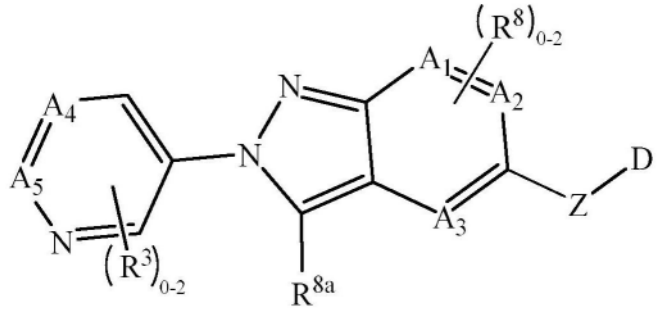
D_2 ;

[0129] 在又一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中D为D_3,

[0130] 

；Z、R^1、R^2以及R^3如上所定义。

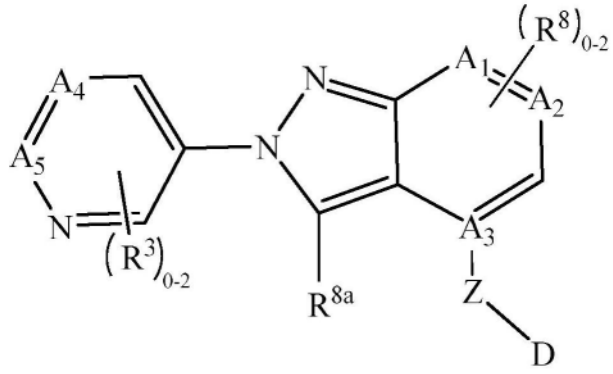
[0131] 在一实施例中，本发明提供一种式(I)化合物，以式(Ia)化合物表示

[0132] 

式(Ia)

[0133] 其中，A_1、A_2、A_3、A_4、A_5、Z、D、R^3、R^8以及R^{8a}如上所定义。

[0134] 在另一实施例中，本发明提供一种式(I)化合物，以式(Ib)化合物表示

[0135] 

式(Ib)

[0136] 其中，A_3为C；A_1、A_2、A_4、A_5、Z、D、R^3、R^8以及R^{8a}如上所定义。

[0137] 在一实施例中，式(1)化合物的基团R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6以及R^7描述为：

[0138] R^1选自C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、苯甲基、苯基以及C_3-C_6杂环基；较佳地C_1-C_6烷基、C_3-C_6环烷基、苯基、苯甲基以及4至6员的芳香或非芳香的杂环。

[0139] R^2选自C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基；较佳地C_1-C_6烷基、C_3-C_6环烷基-C_1-C_6烷基，更佳地C_1-C_6烷基；最佳地甲基或乙基。

[0140] R^3选自由以下所组成的群组：氢、卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_3-C_6环烷基、C_1-C_6烷氧基以及C_1-C_6卤烷基；较佳地氢、卤素以及腈基；C_1-C_3烷基、C_1-C_3卤烷基以及C_1-C_3烷氧基；更佳地氢、氟、氯、甲基、乙基、甲氧基以及CF_3。

[0141] R^4选自由以下所组成的群组C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基以及-NR^cR^d；较佳地C_1-C_6烷基、C_3-C_6环烷基-C_1-C_6烷基、C_3-C_6环烷基、-NR^cR^d以及C_1-C_6卤烷基；更佳地C_1-C_6烷基、C_3-C_6环烷基以及C_1-C_6卤烷

基;

[0142] R^c选自由以下所组成的群组:氢、C_1-C_6烷基、C_3-C_8环烷基;更佳地氢或C_1-C_6烷基;

[0143] R^d选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、苯基以及C_2-C_6杂环基;较佳地C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基以及C_3-C_8环烷基;或者

[0144] R^c以及R^d取代基与其连接的原子或与其他原子可一起形成3至6员的环,该其他原子选自由以下所组成的群组:C、N、O、C(=O)、C(=S)以及$S(O)_{0-2}$,该环可选择地被一或多个

[0145] 选自由以下所组成的群组的取代基取代:卤素、CN或C_1-C_6烷基;

[0146] R^5选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6卤烯基、苯基、苯甲基以及C_2-C_6杂环基;

[0147] 可选择地,R^4以及R^5取代基与其连接的原子或与其他原子可一起形成4至6员的环,该其他原子选自由以下所组成的群组:C、N、O、C(=O)、C(=S)以及$S(O)_{0-2}$,该环可选择性地被一或多个选自由以下所组成的群组的取代基取代:卤素、CN以及C_1-C_6烷基;

[0148] R^6选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基以及C_2-C_6杂环基;较佳地C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基以及C_2-C_6杂环基。

[0149] R^7选自由以下所组成的群组:氢、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_1-C_6烷氧基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、C_2-C_6杂环基以及-COR^5;较佳地氢、腈基、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_1-C_6烷氧基、C_3-C_8环烷基、C_2-C_6杂环基以及-COR^5。

[0150] R^8以及R^{8a}独立地选自由以下所组成的群组:氢、卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、苯基以及C_2-C_6杂环基;较佳地氢、卤素、腈基、C_1-C_6烷基以及C_1-C_6卤烷基。

[0151] 其中,R^1、R^2、R^4、R^5、R^6以及R^7的各脂肪族基团可选择性地被R^a的一或多个基团取代,且R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6以及R^7的环基团可选择地被R^b的一或多个基团取代,

[0152] R^a选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷硫基、苯基以及C_2-C_6杂环基;

[0153] R^b选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-

[0154] C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷硫基、C_1-C_6卤烷硫基、C_1-C_6烷氧基以及C_1-C_6卤烷氧基。

[0155] 此外,本公开描述的实施例可以以任何方式组合,并且实施例中变量的描述不仅涉及式(I)的化合物,而且涉及起始化合物以及可用于制备该式(I)化合物的中间体化合物。

[0156] 在此意义上,可以根据本发明进行组合的实施例,如下所示:

[0157] 在一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中,

[0158] D为D_1;

[0159] Z为直接键或-C(=O)-;较佳地Z为直接键;

[0160] R^3选自由以下所组成的群组:氢、卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基以及C_1-C_6烷氧基;R^4选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基以及-NR^cR^d;

[0161] 其中,R^c选自以下所组成的群组:氢或C_1-C_6烷基;

[0162] R^d选自以下所组成的群组:氢或C_1-C_6烷基;

[0163] R^5选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、苯基、苯甲基以及C_2-C_6杂环基;或者

[0164] R^4以及R^5取代基与其连接的原子或与其他原子可一起形成4至6员的环,该其他原子选自由以下所组成的群组:C、N、O、C(=O)、C(=S)以及$S(O)_{0-2}$,该环可选择地被一或多个选自由以下所组成的群组的取代基取代:卤素、CN以及C_1-C_6烷基。

[0165] 其中,R^5、R^6以及R^7的各脂肪族基团可选择性地被R^a的一或多个基团取代,且R^4以及R^5的环基团可选择地被R^b的一或多个基团取代,

[0166] R^a选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷硫基、苯基以及C_2-C_6杂环基;

[0167] R^b选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷硫基、C_1-C_6卤烷硫基、C_1-C_6烷氧基以及C_1-C_6卤烷氧基;

[0168] R^8以及R^{8a}独立地选自由以下所组成的群组:氢、卤素、腈基、C_1-C_4烷基以及C_1-C_4卤烷基;

[0169] A_1、A_2、A_3、A_4、A_5如上所定义;

[0170] 或其盐、立体异构物、互变异构物、多晶型物、金属配合物或N-氧化物。

[0171] 在另一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中,

[0172] D为D_2;

[0173] Z为直接键;

[0174] R^3选自由以下所组成的群组:氢、卤素、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基以及C_1-C_6烷氧基;

[0175] R^6选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、-NR^cR^d、苯基、苯甲基以及C_2-C_6杂环基;较佳地R^6选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基以及-NR^cR^d;

[0176] 其中,R^c选自以下所组成的群组:氢或C_1-C_6烷基;

[0177] R^d选自以下所组成的群组:氢或C_1-C_6烷基;

[0178] R^7独立地选自由以下所组成的群组:氢、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_1-C_6烷氧基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、苯基、苯甲基、C_2-C_6杂环基、C_2-C_6杂环基-C_1-C_6烷基以及-COR^5;较佳地R^7选自由以下所组成的群组:氢、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_3-C_8环烷基-C_1-C_6烷基、-COR^5、苯基、苯甲基、C_2-C_6杂环基以及腈基;

[0179] 其中,R^5选自由以下所组成的群组:C_1-C_6烷基以及C_3-C_8环烷基;

[0180] 其中,R^5、R^6以及R^7的各脂肪族基团可选择性地被R^a的一或多个基团取代;以及R^5、R^6以及R^7的环基团可选择地被R^b的一或多个基团取代,其中,

[0181] R^a选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷硫基、苯基以及C_2-C_6杂环基;

[0182] R^b选自由以下所组成的群组:卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷硫基、C_1-C_6卤烷硫基、C_1-C_6烷氧基以及C_1-C_6卤烷氧基;

[0183] A_1、A_2、A_3、A_4以及A_5如上所定义；

[0184] 或其盐、立体异构物、互变异构物、多晶型物、金属配合物或N-氧化物。

[0185] 在又一实施例中，本发明提供一种式(I)化合物，其中，

[0186] D为D_3；

[0187] Z为直接键；

[0188] R^2为C_1-C_6烷基；

[0189] R^3选自由以下所组成的群组：氢、卤素、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基以及C_1-C_6烷氧基；

[0190] R^1选自C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_6环烷基、C_3-C_6环烷基-C_1-C_6烷基、苯基、苯甲基、苯乙基以及4至6员的杂环基；

[0191] R^1的各脂肪族基团可选择性地被R^a的一或多个基团取代；以及R^1的环基团可选择地被R^b的一或多个基团取代，其中，

[0192] R^a选自由以下所组成的群组：卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_1-C_6卤烷基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷氧基、C_1-C_6烷硫基、苯基以及C_2-C_6杂环基；

[0193] R^b选自由以下所组成的群组：卤素、腈基、C_1-C_6烷基、C_2-C_6烯基、C_2-C_6炔基、C_1-

[0194] C_6卤烷基、C_2-C_6卤烯基、C_3-C_8环烷基、C_1-C_6烷硫基、C_1-C_6卤烷硫基、C_1-C_6烷氧基以及C_1-C_6卤烷氧基；

[0195] R^8以及R^{8a}独立地选自由以下所组成的群组：氢、卤素、腈基、C_1-C_4烷基以及C_1-C_4卤烷基；

[0196] 或其盐、立体异构物、互变异构物、多晶型物、金属配合物或N-氧化物。

[0197] 在一实施例中，本发明提供一种式(I)化合物，其中，R^1基团的C_2-C_6杂环基较佳地选自部分/完全饱和或未饱和的呋喃基、噻吩基、吡咯基、异恶唑基、噻唑基、异噻唑基、噻二唑基、吡唑基、恶唑基、咪唑基、恶二唑基、三唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基或吡嗪基。

[0198] 在一实施例中，本发明提供一种式(I)化合物，其中，R^5基团的C_2-C_6杂环基较佳地选自部分/完全饱和或未饱和的呋喃基、噻吩基、吡咯基、异恶唑基、噻唑基、异噻唑基、噻二唑基、吡唑基、恶唑基、咪唑基、恶二唑基、三唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基或吡嗪基。

[0199] 在一实施例中，本发明提供一种式(I)化合物，其中，R^6基团的C_2-C_6杂环基较佳地选自氧杂环丁基、部分/完全饱和或未饱和的呋喃基、噻吩基、吡咯基、异恶唑基、噻唑基、异噻唑基、噻二唑基、吡唑基、恶唑基、咪唑基、恶二唑基、三唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基或吡嗪基。

[0200] 在一实施例中，本发明提供一种式(I)化合物，其中，R^7基团的C_2-C_6杂环基较佳地选自部分/完全饱和或未饱和的呋喃基、噻吩基、吡咯基、异恶唑基、噻唑基、异噻唑基、噻二唑基、吡唑基、恶唑基、咪唑基、恶二唑基、三唑基、吡啶基、哒嗪基、嘧啶基或吡嗪基。

[0201] 在一实施例中，本发明提供一种式(I)化合物，其中A_1、A_2、A_3、A_4以及A_5独立地为C。

[0202] 在另一实施例中，本发明提供一种式(I)化合物，其中A_1、A_2、A_3以及A_5独立地为C，且A_4为N。

[0203] 在又一实施例中，本发明提供一种式(I)化合物，其中A_1、A_2、A_3以及A_4独立地为C，且A_5为N。

[0204] 在又一实施例中，本发明提供一种式(I)化合物，其中A_1、A_2、A_4以及A_5独立地为C，且A_3为N。

[0205] 在又一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中A_2、A_3、A_4以及A_5独立地为C,且A_1为N。

[0206] 在又一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中A_1、A_3、A_4以及A_5独立地为C,且A_2为N。

[0207] 在又一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中A_1以及A_3独立地为N,且A_2、A_4以及A_5独立地为C。

[0208] 在又一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中A_2以及A_3独立地为N,且A_1、A_4以及A_5独立地为C。

[0209] 在又一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中A_2以及A_4独立地为N,且A_1、A_3以及A_5独立地为C。

[0210] 在又一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中A_1、A_3以及A_4独立地为N,且A_2以及A_5独立地为C。

[0211] 在又一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中A_2、A_3以及A_4独立地为N,且A_1以及A_5独立地为C。

[0212] 在一较佳实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中A_1、A_2、A_3、A_4以及A_5独立地为C。

[0213] 在另一较佳的实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中A_1、A_2、A_3以及A_5独立地为C且A_4为N。

[0214] 在又一较佳的实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中A_1、A_2、A_4以及A_5独立地为C且A_3为N。

[0215] 在又一较佳的实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中A_1、A_2以及A_5独立地为C且A_3以及A_4独立地为N。

[0216] 在又一较佳的实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中A_2、A_3、A_4以及A_5独立地为C且A_1为N。

[0217] 在又一较佳的实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中A_2、A_3以及A_5独立地为C且A_1以及A_4为N。

[0218] 在一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中D为D_1,且Z为直接键。

[0219] 在另一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中D为D_1,且Z为-C(=O)-。

[0220] 在一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中D为D_2,且Z为直接键。

[0221] 在一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中D为D_3,且Z为直接键。

[0222] 在一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中D为D_1或D_2,且Y为O。

[0223] 在一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中D为D_1或D_2,且Y为NR^7。

[0224] 在一较佳实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中D为D_1或D_2,且Y为O。

[0225] 在一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^1为C_1-C_6烷基。

[0226] 在另一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^1为C_1-C_6烷基,其由可选择地经取代的苯基取代;其中该可选择地取代基选自卤素、CN、甲基或甲氧基。

[0227] 在一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^2为C_1-C_6烷基。

[0228] 在一较佳实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^2为甲基或乙基。

[0229] 在一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^3为C_1-C_6烷基。

[0230] 在另一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^2为C_1-C_6卤烷基。

[0231] 在又一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^3为卤素。

[0232] 在又一实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^3为C_1-C_6烷氧基。

[0233] 在一较佳实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^3为CF_3。

[0234] 在另一较佳实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^3为氟或氯。

[0235] 在一较佳实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^4为C_1-C_6烷基。

[0236] 在一较佳实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^4为C_1-C_6烷基,可选择地被R^a取代,其中R^a选自F、CN、甲基、乙基、(正、异)丙基、甲氧基、CF_3、环丙基、C_2-C_6杂环基;

[0237] 在一较佳实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^5为C_1-C_6烷基。

[0238] 在一较佳实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^5为C_1-C_6烷基,可选择地被R^a取代,其中R^a选自F、CN、甲基、乙基、(正、异)丙基、甲氧基、CF_3、环丙基、C_2-C_6杂环基;

[0239] 在一较佳实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^6为C_1-C_6烷基。

[0240] 在一较佳实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^6为C_1-C_6烷基,可选择地被R^a取代,其中R^a选自F、CN、甲基、乙基、(正、异)丙基、甲氧基、CF_3、环丙基、C_2-C_6杂环基。

[0241] 在一较佳实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^7为C_1-C_6烷基、-COR^5以及C_2-C_6杂环基。

[0242] 在一实施例中,R^8以及R^{8a}独立地选自由以下所组成的群组:氢、卤素、腈基、C_1-C_4烷基、C_1-C_4卤烷基;

[0243] 在一较佳实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中R^8以及R^{8a}独立地选自由以下所组成的群组:氢、氯、氟、腈基、甲基、乙基、异丙基以及CF_3;

[0244] 在一较佳实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中C_3-C_6烷基选自环丙基、环丁基、环戊基或环已基。较佳地,环丙基或环丁基。

[0245] 在一较佳实施例中,本发明提供一种式(I)化合物,其中A_1、A_2、A_3、A_4以及A_5独立地为C;或者A_1、A_2、A_3以及A_5独立地为C,且A_4为N;或者A_1、A_2、A_4以及A_5独立地为C,且A_3为N;或者A_1、A_2以及A_5独立地为C,且A_3以及A_4独立地为N;或者A_2、A_3、A_4以及A_5独立地为C且A_1为N;或者A_2、A_3以及A_5独立地为C,且A_1与A_4独立地为N。

[0246] 本发明也涉及一种式(I)化合物的制备方法。

[0247] 本发明的化合物可以一或多个立体异构物存在。不同的立体异构物包含镜像异构物、非镜像异构物、阻转异构物以及几何异构物。所属技术领域中具有通常知识者将理解,当相对于其他立体异构物富集时或当与其他立体异构物分离时,一种立体异构物可以更具活性及/或可以表现出更有益的效果。另外,所属技术领域中具有通常知识者知悉如何分离、富集及/或选择性制备所述立体异构物。本发明的化合物可以作为立体异构物的混合物、单独的立体异构物或作为光学活性形式存在。

[0248] 在式(I)化合物作为盐的阳离子部分出现或能够形成盐的这种阳离子部分的情况下,相应的阴离子部分可以是无机的或有机的。或者,在式(I)化合物作为盐的阴离子部分出现或能够形成盐的这种阴离子部分的情况下,相应的阳离子部分可以是无机的或有机的。盐的无机阴离子部分的实例包括但不限于氯离子、溴离子、碘离子、氟离子、硫酸根、磷酸根、硝酸根、亚硝酸根、碳酸氢根以及硫酸氢根。盐的有机阴离子部分的实例包括但不限于甲酸盐、链烷酸盐、碳酸盐、乙酸盐、三氟乙酸盐、三氯乙酸盐、丙酸盐、乙醇酸盐、硫氰酸

盐、乳酸盐、琥珀酸盐、苹果酸盐、柠檬酸盐、苯甲酸盐、肉桂酸盐、草酸盐、烷基硫酸盐、烷基磺酸盐、芳基磺酸盐、芳基二磺酸盐、烷基膦酸盐、芳基膦酸盐、芳基二膦酸盐、对甲苯磺酸盐以及水杨酸盐。盐的无机阳离子部分的实例包括但不限于碱金属以及碱土金属。盐的有机阳离子部分的实例包括但不限于衍生自吡啶、甲胺、咪唑、苯并咪唑、组胺酸、磷腈、四甲基铵、四丁基铵、胆碱以及三甲基胺的阳离子。

[0249] 式(I)化合物的金属配合物中的金属离子尤其为第二主族元素的离子,特别是钙及镁的离子,第三及第四主族元素的离子,特别是铝、锡及铅的离子,以及第一至第八过渡族,特别是铬、锰、铁、钴、镍、铜、锌等。特别佳的为第四周期及第一至第八过渡族元素的金属离子。此处,金属可以以它们可以呈现的各种化合价存在。

[0250] 本发明的另一实施例公开了式(I)化合物、其盐、金属配合物、立体异构物、非镜像异构物、镜像异构物、掌性异构物、阻转异构物、构象异构物、旋转异构物、互变异构物体、光学异构物、多晶型物、几何异构物或N-氧化物以及含有赋形剂、惰性载体或任何其他必要成分(例如表面活性剂、添加剂、固体稀释剂以及液体稀释剂)的组成物。

[0251] 选自式(I)的化合物(包括其所有立体异构物、N-氧化物及盐)通常以多于一种形式存在,因此式(I)包括所有式(I)化合物所表示的结晶以及非结晶形式。非结晶形式包括固体(例如蜡及树胶)的实施例以及液体(例如溶液及熔体)的实施例。晶型包括代表基本上单晶类型的实施例以及代表多晶型物(即不同晶型)的混合物的实施例。用语“多晶型物”(polymorph)是指可以不同晶型结晶的化合物的特定晶型,这些晶型在晶格中具有不同的分子排列及/或立体构形。尽管多晶型物可以具有相同的化学组成,但由于共结晶水或其他分子的存在或不存在,它们的组成也可能不同,共结晶水或其他分子可以弱或强地结合在晶格中。多晶型物的化学、物理以及生物特性(例如晶体形状、密度、硬度、颜色、化学稳定性、熔点、吸湿性、悬浮性、溶解速率以及生物利用度)可能不同。所属技术领域中具有通常知识者将理解,相对于另一种由式(I)表示的化合物的多晶型物或多晶型物的混合物,由式(I)表示的化合物的多晶型物可以表现出有益效果(例如,适用于制备有用的制剂(formulations)、改善的生物性能)。由式(I)表示的化合物的特定多晶型物的制备及分离可以通过所属技术领域中具有通常知识者已知的方法实现,包括,例如使用选择的溶剂及温度进行结晶。

[0252] 本发明还涉及用于控制或预防昆虫及螨虫害虫的组成物。所述组成物包含生物有效量的式(I)化合物及至少一种选自界面活性剂及助剂的额外组分。

[0253] 本发明的另一实施例是有关式(I)化合物或其N-氧化物或其盐制备为常规类型的农业化学组成物,例如:溶液、乳液、悬浮液、粉剂、散剂、膏剂、粒剂、压制剂、胶囊及其混合物。组成物类型的例子是悬浮液(例如SC、OD、FS)、可乳化浓缩物(例如EC)、乳液(例如EW、EO、ES、ME)、胶囊(例如CS、ZC)、糊剂、锭剂、可湿性粉剂或散剂(例如WP、SP、WS、DP、DS)、压制剂(例如BR、TB、DT)、粒剂(例如WG、SG、GR、FG、GG、MG)、杀虫制品(例如LN)以及用于处理植物繁殖材料如种子(例如GF)的凝胶制剂。这些及其他组成物类型在“Catalogue of pesticide Formulation types and international coding system,Technical Monograph No.2,6th Ed.May 2008,CropLife International”中进行了定义。

[0254] 上述组成物以已知方式制备,例如于Mollet以及Grubemann所著的“Formulation Technology,Wiley VCH,Weinheim,2001”中所述;或于Knowles所著的“New Developments

in Crop Protection Product Formulation,Agrow Reports DS243,T&F Informa, London,2005”中所述。用于根据本发明的制剂及/或农业化学组成物的合适助剂的实例是溶剂、液体载体、固体载体或填充剂,界面活性剂、分散剂、乳化剂、润湿剂、佐剂(adjuvants)、增溶剂、渗透促进剂、保护胶体、黏合剂、增稠剂、保湿剂、驱虫剂、引诱剂、摄食刺激剂、增容剂、杀菌剂、抗冻剂、消泡剂、着色剂、增黏剂及接着剂。

[0255] 本文中的合适的溶剂及液体载体是,举例而言,水及有机溶剂,例如中至高沸点的矿物油分馏物,例如煤油、柴油;植物油或动物油;脂肪族、环及芳香族烃,例如甲苯、石蜡、四氢萘、烷基化萘化合物;醇类,例如乙醇、丙醇、丁醇、苯甲醇、环己醇;乙二醇;二甲基亚砜(DMSO);酮类,例如环己酮;酯类,例如乳酸酯、碳酸酯、脂肪酸酯、γ-丁内酯;脂肪酸;磷酸盐;胺类;酰胺类,例如N-甲基吡咯烷酮,脂肪酸二甲基酰胺;及其混合物。合适的固体载体或填料是矿物土,例如硅酸盐、硅胶、滑石、高岭土、石灰石、石灰、白垩岩、黏土、白云石、硅藻土、膨润土、硫酸钙、硫酸镁、氧化镁;多醣,例如纤维素、淀粉;肥料,例如硫酸铵、磷酸铵、硝酸铵、尿素;植物来源的产品,例如谷物粉、树皮粉、木粉、坚果壳粉及其混合物。

[0256] 合适的界面活性剂是表面活性化合物,例如阴离子型、阳离子型、非离子型及两性界面活性剂、嵌段聚合物、聚电解质及其混合物。此类界面活性剂可作为乳化剂、分散剂、增溶剂、润湿剂、渗透促进剂、保护胶体或佐剂使用。界面活性剂的实例列于“McCutcheoN’s, Vol.1:Emulsifiers&Detergents,McCutcheoN’s Directories,Glen Rock,USA,2008”(国际版或北美版)当中。

[0257] 合适的阴离子界面活性剂,举例而言,是磺酸盐、硫酸盐、磷酸盐、羧酸盐及其混合物的碱金属盐、碱土金属盐或铵盐。磺酸盐的实例是烷基芳基磺酸盐、二苯磺酸盐、α-烯烃磺酸盐、木质素磺酸盐、脂肪酸及油的磺酸盐、乙氧基化的烷基酚类的磺酸盐、烷氧基化的芳基酚类的磺酸盐、缩合萘的磺酸盐、癸基及十三烷基苯的磺酸盐、萘及烷基萘的磺酸盐、磺基琥珀酸盐或磺基琥珀酰胺酸盐。硫酸盐的实例是脂肪酸及油的硫酸盐、乙氧基化烷基酚的硫酸盐、醇的硫酸盐、乙氧基化的醇类的硫酸盐或脂肪酸酯的硫酸盐。磷酸盐的例子是磷酸酯。羧酸盐的例子是烷基羧酸盐及羧化的醇类或烷基酚乙氧基化物。

[0258] 合适的非离子界面活性剂,举例而言,是烷氧基化物、N-取代的脂肪酸酰胺、氧化胺、酯类、糖基的界面活性剂、聚合物界面活性剂及其混合物。烷氧基化物的实例是已被1至50当量烷氧基化的化合物,例如醇类、烷基酚类、胺类、酰胺类、芳基酚类、脂肪酸类或脂肪酸酯类。环氧乙烷及/或环氧丙烷可用于烷氧基化反应,较佳为环氧乙烷。

[0259] N-取代的脂肪酸酰胺的例子是脂肪酸葡糖酰胺或脂肪酸链烷醇酰胺。酯的例子是脂肪酸酯、甘油酯或甘油单酯。糖基的界面活性剂的例子是脱水山梨糖醇、乙氧基化的脱水山梨糖醇、蔗糖及葡萄糖酯或是烷基多醣苷。聚合物界面活性剂的例子是乙烯基吡咯烷酮、乙烯醇或醋酸乙烯酯的均聚物或共聚物。

[0260] 合适的阳离子界面活性剂,举例而言,是四级界面活性剂,例如具有一或两个疏水基团的四级铵化合物,或长链一级胺的盐。合适的两性界面活性剂是烷基甜菜碱及咪唑啉。合适的嵌段聚合物,举例而言,是包含聚环氧乙烷及聚环氧丙烷嵌段的A-B或A-B-A型嵌段聚合物,或是包含链烷醇、聚环氧乙烷及聚环氧丙烷的A-B-C型嵌段聚合物。合适的聚电解质,举例而言,是多元酸或多元碱。多元酸的例子是聚丙烯酸的碱金属盐或多元酸梳形聚合物(polyacid comb polymers)。多元碱的例子是聚乙烯胺(polyvinyl amines或

polyethylene amines)。

[0261] 合适的佐剂是本身具有可忽略的或甚至没有杀虫活性的化合物,其改善式(I)化合物对目标的生物学表现。佐剂举例来说为界面活性剂、矿物油或植物油以及其他助剂。于"Knowles,Adjuvants and added,Agrow Reports DS256,T&F Informa UK,2006,Chapter 5"中列出了进一步的例子。

[0262] 合适的增稠剂,举例而言,是多醣(例如三仙胶、羧甲基纤维素)、无机黏土(有机改质或未改质)、聚羧酸盐及硅酸盐。

[0263] 合适的杀菌剂,举例而言,是溴硝醇(bronopol)及异噻唑啉酮衍生物,例如烷基异噻唑啉酮(alkylisothiazolinones)及苯并异噻唑啉酮(benzisothiazolinones)。

[0264] 合适的抗冻剂,举例而言,是乙二醇、丙二醇、尿素及甘油。

[0265] 合适的消泡剂,举例而言,是聚硅氧化合物、长链醇及脂肪酸的盐。

[0266] 合适的着色剂(例如红色、蓝色或绿色),举例而言,是低水溶性颜料及水溶性染料。实例为无机着色剂(如氧化铁、氧化钛、六氰基铁)及有机着色剂(例如茜素的、偶氮的及酞菁的着色剂)。

[0267] 合适的增黏剂或接着剂,举例而言,是聚乙烯吡咯烷酮、聚乙烯醋酸酯、聚乙烯醇、聚丙烯酸酯、生物或合成蜡及纤维素醚。

[0268] 组成物的类型及其制备方式如下:

[0269] i)水溶性浓缩物(SL,LS)

[0270] 10-60wt%的式(I)化合物以及5-15wt%润湿剂(例如醇烷氧基化合物)溶解于加至100

[0271] wt%的水及/或水溶性溶剂(例如醇类)之中。该活性物质在以水稀释时溶解。

[0272] ii)可分散浓缩物(DC)

[0273] 5-25wt%的式(I)化合物以及1-10wt%的分散剂(例如聚乙烯吡咯烷酮)溶解于加至100wt%的有机溶剂(例如环己酮)之中。以水稀释得到活性物质的分散液。

[0274] iii)可乳化浓缩物(EC)

[0275] 15-70wt%的式(I)化合物以及5-10wt%的乳化剂(例如十二烷基苯磺酸钙及乙氧基化蓖麻油)溶解于加至100wt%的不溶于水的有机溶剂(例如芳香烃)之中。以水稀释得到活性物质的乳液。

[0276] iv)乳液(EW,EO,ES)

[0277] 5-40wt%的式(I)化合物以及1-10wt%的乳化剂(例如十二烷基苯磺酸钙及乙氧基化蓖麻油)溶解于20-40wt%的不溶于水的有机溶剂(例如芳香烃)。接着,通过使用乳化机的方式,该混合物被加入到加至100wt%的水中,使其呈现均匀乳液。以水稀释得到活性物质的乳液。

[0278] v)悬浮液(SC,OD,FS)

[0279] 于20-60wt%的式(I)化合物中加入2-10wt%的分散剂及润湿剂(例如木质素磺酸钠及醇乙氧基化物)、0.1-2wt%的增稠剂(例如三仙胶)以及加至100wt%的水在搅拌球磨机中进行粉碎,而得到良好的活性物质悬浮液。以水稀释得到活性物质的稳定悬浮液。对于FS型组成物,最多添加40wt%的黏合剂(例如聚乙烯醇)。

[0280] vi)水分散性粒剂及水溶性粒剂(WG,SG)

[0281] 将50-80wt％的式(I)化合物加入加至100wt％的分散剂及润湿剂(例如木质素磺酸钠及醇乙氧基化物)进行细磨,并通过技术设备(例如挤压、喷雾塔、流化床)制备成水分散性或水溶性颗粒。以水稀释得到活性物质的稳定分散体或溶液。

[0282] vii)水分散性散剂及水溶性散剂(WP,SP,WS)

[0283] 将50-80wt％的式(I)化合物在加入1-5wt％的分散剂(例如木质素磺酸钠)、1-3wt％的润湿剂(例如醇乙氧基化物)及加至100wt％的固体载体(例如硅胶)的情况下于转子-定子研磨机中进行研磨。以水稀释得到活性物质的稳定分散液或溶液。

[0284] viii)凝胶(GW,GF)

[0285] 于5-25wt％的式(I)化合物中加入3-10wt％的分散剂(例如木质素磺酸钠)、1-5wt％的增稠剂(例如羧甲基纤维素)以及加至100wt％的水在搅拌球磨机中进行粉碎,而得到良好的活性物质悬浮液。以水稀释得到活性物质的稳定悬浮液。

[0286] ix)微乳液(ME)

[0287] 5-20wt％的式(I)化合物被添加至5-30wt％的有机溶剂混合物(例如脂肪酸二甲基酰胺及环己酮)、10-25wt％的界面活性剂混合物(例如醇乙氧基化物及芳基苯酚乙氧基化物)以及加至100％wt的水。该混合物被搅拌1小时以自发地产生热力学稳定的活性成分的微乳液。

[0288] x)微胶囊(CS)

[0289] 包括5-50wt％的式(I)化合物、0-40wt％的不溶于水的有机溶剂(例如芳香烃)以及2-15wt％的丙烯酸单体(例如甲基丙烯酸甲酯、甲基丙烯酸以及二丙烯酸酯或三丙烯酸酯)的油相被分散至保护胶体(例如聚乙烯醇)的水溶液中。自由基聚合化反应导致聚(甲基)丙烯酸酯微胶囊的形成。可替代地,包括5-50wt％的本发明的式(I)化合物、0-40wt％的不溶于水的有机溶剂(例如芳香烃)以及异氰酸酯单体(例如二苯基亚甲基-4,4’-二异氰酸酯(diphenylmethene-4,4’-diisocyanatae))的油相被分散至保护胶体(例如聚乙烯醇)的水溶液中。多胺(例如六亚甲基二胺)的加入导致聚脲微胶囊的形成。单体的量为1-10wt％。其重量百分比与总CS组成物相关。

[0290] xi)可粉化粉剂(DP,DS)

[0291] 1-10wt％的式(I)化合物被细磨并与加至100wt％的固体载体(例如细碎的高岭土)紧密混合。

[0292] xii)粒剂(GR,FG)

[0293] 0.5-30wt％的式(I)化合物被细磨并与加至100wt％的固体载体(例如硅酸盐)结合。造粒是通过挤压、喷雾干燥或流化床实现的。

[0294] xiii)超低容积液体(UL)

[0295] 1-50wt％的式(I)化合物被溶解于加至100wt％的有机溶剂(例如芳香烃)中。

[0296] 组成物类型i)至xiii)可选择地包括进一步的助剂,例如0.1-1wt％的杀菌剂、5-15wt％的抗冻剂、0.1-1wt％的消泡剂以及0.1-1wt％的着色剂。

[0297] 本发明的另一个实施例提供含有式(I)化合物的农业化学组合物,其包含按重量计0.01％至95％、较佳0.1％至90％、更佳1％至70％、特别是10％至60％的活性物质。活性物质以90％至100％、较佳95％至100％(根据NMR光谱)的纯度使用。

[0298] 水溶性浓缩物(LS)、悬乳剂(suspoemulsions,SE)、流动性浓缩物(flowable

concentrates,FS)、用于干处理的散剂(DS)、用于浆液处理的水分散散剂(WS)、水溶性散剂(SS)、乳液(ES)、可乳化的浓缩物(EC)以及凝胶制剂(GF)是通常使用于用于处理植物繁殖材料(特别是种子)的用途。在经过二至十倍稀释后,所述组成物在即用型配制品中,以重量计,其活性物质浓度为0.01至60%,较佳为0.1至40%。可在播种前或播种期间进行施用。

[0299] 将式(I)化合物及其组成物分别施用于植物繁殖材料,尤其是种子上的方法包括:拌种(dressing)、包衣(coating)、制粒、撒粉、浸种(soaking)以及沟内施药(in-furrow application)方法。较佳地,将式(I)化合物及其组成物分别通过不诱导发芽的方法(例如通过拌种、制粒、包衣及撒粉)施用于植物繁殖材料。

[0300] 当使用于植物保护时,施用的活性物质的量,依据预期效果的类型,为每公顷0.001至2公斤,较佳为每公顷0.005至2公斤,更佳为每公顷0.05至0.9公斤,特别是每公顷0.1至0.75公斤。

[0301] 对于处理植物繁殖材料(如种子)时,例如通过撒粉、包衣(coating)或浸湿种子,每100公斤的植物繁殖材料(较佳为种子),0.1至1000克,较佳为1至1000克,更佳为1至100克,且更佳为5至100克的活性成分通常是必需的。

[0302] 当使用于保护材料或储存产品时,活性物质的用量取决于应用领域的类型及所需的效果。通常用于材料保护的量为自0.001克至2公斤的范围,较佳为自0.005克至1公斤活性物质/每立方米处理材料。

[0303] 不同类型的油、润湿剂、佐剂、肥料或微量营养素以及额外的杀虫剂(例如除草剂、杀虫剂、杀真菌剂、生长调节剂、防护剂(safeners))可以作为预混物添加到活性物质或包含活性物质的组成物中,或者,如果合适的话直到使用前再添加(罐混合)。这些试剂可以与根据本发明的组成物以1:100至100:1,较佳为1:10至10:1的重量比混合。

[0304] 用户通常从给药前装置、背负式喷雾器、喷雾罐、飞机喷雾或灌溉系统施用本发明的农业组成物。通常地,农业组成物是由水、缓冲剂及/或其他助剂制成所需的施用浓度,从而获得本发明的即用型喷雾液或农业组成物。通常地,每公顷农业有用面积施用20至2000公升,较佳为50至400升的即用型喷雾液。

[0305] 根据一实施例,根据本发明的组成物的各个组分,例如试剂盒的部分或是二元或三元混合物的部分,可由使用者自己在喷雾罐或其他辅助设备予以混合,如果合适的话。

[0306] 本发明的化合物及组成物因此在农艺学上可用于保护农作物免受植物病源性无脊椎动物害虫的侵害,且在非农艺学上也可用于保护其他园艺作物及植物免受植物病源性无脊椎动物害虫的侵害。该应用包括保护含有通过基因工程(即基因转殖)引入或通过诱变修饰以提供有利性状的遗传物质的作物及其他植物(即农艺及非农艺)。

[0307] 本发明的化合物的特征为良好的代谢及/或土壤剩余模式(residual pattern),且表现出控制一范围的农艺学及非农艺学无脊椎动物害虫的活性。本发明的化合物在害虫控制领域是具有预防及/或治疗价值的活性成分,即使在低施用率下,也可用于控制抗杀虫剂害虫(例如昆虫)及/或具有非常有利的杀生物谱(biocidal spectrum),且温血动物、鱼类及植物对其具有良好的忍受度。

[0308] 本发明的化合物显示出对抗经济上重要的农艺、森林、温室、苗圃、观赏植物、食物与纤维、公共与动物健康、家用与商用结构、家庭及储存产品害虫的活性。这些害虫包括鳞翅目(Lepidoptera)的幼虫,诸如夜蛾科的黏虫(armyworm)、切根虫(cutworm)、尺蠖

(looper)及美洲虫种(heliothine)(例如,秋季夜蛾(fall armyworm、Spodoptera fugiperda J.E.Smith)、甜菜夜蛾(beet armyworm、Spodoptera exigua Hubner)、球菜夜蛾(black cutworm、Agrotis ipsilon Hufnagel)、粉纹夜蛾(cabbage looper、Trichoplusia ni Hubner)、烟草夜蛾(tobacco budworm、Heliothis virescens Fabricius));源自螟蛾科(Pyralidae)的螟虫(borer)、鞘蛾幼虫(casebearer)、结网毛虫(webworm)、松果螟(coneworm)、甘蓝菜害虫(cabbageworm)及卷叶野螟(skeletonizer)(例如,欧洲玉米螟(European corn borer、Ostrinia nubilalis Hubner)、脐橙螟(navel orangeworm、Amyelois transitella Walker)、玉米根结网毛虫(corn root webworm、Crambus caliginosellus Clemens)、草地虫(sod worm、Herpetogramma licarsisalis Walker));卷蛾科(Tortricidae)的卷叶蛾(leafroller)、蚜虫(budworm)、籽蛾(seed worm)及果蛾(fruit worm)(例如,苹果蠹蛾(codling moth、Cydia pomonella Linnaeus)、葡萄浆果小卷蛾(grape berry moth、Endopiza viteana Clemens)、东方果蛾(oriental fruit moth、Grapholita molesta Busck));以及许多其他经济学上重要的鳞翅目(例如,小菜蛾(diamondback moth、Plutella xylostella Linnaeus)、红铃虫(pink bollworm、Pectinophora gossypiella Saunders)、舞毒蛾(gypsy moth、Lymantria dispar Linnaeus));蜚蠊目(Blattodea)的若虫(nymph)及成虫,其包括源自姬蜚蠊(Blattellidae)及蜚蠊科(Blattidae)的蜚蠊(cockroach)(例如,东方蜚蠊(oriental cockroach、Blatta orientalis Linnaeus)、亚洲蜚蠊(Asian cockroach、Blatella asahinai Mizukubo)、德国小蠊(German cockroach、Blattella germanica Linnaeus)、褐带蜚蠊(brownbanded cockroach、Supella longipalpa Fabricius)、美洲大蠊(American cockroach、Periplaneta Americana Linnaeus)、褐色大蠊(brown cockroach、Periplaneta brunnea Burmeister)、马德拉蜚蠊(Madeira cockroach、Leucophaea maderae Fabricius));鞘翅目(Coleoptera)的食叶幼虫及成虫,其包括源自长角象虫科(Anthribidae)、豆象科(Bruchidae)及象虫科(Curculionidae)的象甲(weevil)(例如,棉铃象甲(boll weevil、Anthonomus grandis Boheman)、稻水象甲(rice water weevil、Lissorhoptrus oryzophilus Kuschel)、谷象(granary weevil、Sitophilus granaries Linnaeus)、米象(rice weevil、Sitophilus oryzae Linnaeus));金花虫科(Chrysomelidae)的跳甲(flea beetle)、黄瓜叶甲(cucumber beetle)、根虫(rootworm)、叶甲(leaf beetle)、薯虫(potato beetle)及潜叶蛾(leafminer)(例如,科罗拉多薯虫(Colorado potato beetle、Leptinotarsa decemlineata Say)、西方玉米根虫(western corn rootworm、Diabrotica virgifera LeConte));源自金龟子科(Scaribaeidae)的金龟子(chafer)及其他甲虫(例如,日本丽金龟(Japanese beetle、Popillia japonica Newman)及欧洲金龟子(European chafer、Rhizotrogus majalis Razoumowsky));源自皮蠹科(Dermestidae)的地毯甲虫(carpet beetle);源自叩甲科(Elateridae)的金针虫(wireworm);源自小蠹科(Scolytidae)的小蠹虫(bark beetle)及源自拟步甲科(Tenebrionidae)的黄粉虫(flour beetle)。此外,其还包括:革翅目(Dermaptera)的成虫及幼虫,其包括源自蠼螋科(Forficulidae)的地蜈蚣(earwig)(例如,欧洲地蜈蚣(European earwig、Forficula auricularia Linnaeus)、黑地蜈蚣(black earwig、Chelisoches morio Fabricius));半翅目(Hemiptera)及同翅目(Homoptera)的成虫及若

虫,诸如源自盲蝽科(Miridae)的盲蝽(plant bug)、源自蝉科(Cicadidae)的蝉(cicada)、源自叶蝉科(Cicadellidae)的叶蝉(leafhopper)(例如小绿叶蝉属(Empoasca spp.))、源自蜡蝉科(Fulgoroidae)及飞虱科(Delphacidae)的飞虱(planthopper)、源自木虱科(Psyllidae)的木虱(psyllid)、源自粉虱科(Aleyrodidae)的粉虱(whitefly)、源自蚜科(Aphididae)的蚜虫(aphid)、源自根瘤蚜科(Phylloxeridae)的根瘤蚜(phylloxera)、源自粉蚧科(Pseudococcidae)的粉蚧(mealybug)、源自蚧科(Coccidae)、盾蚧科(Diaspididae)及绵蚧科(Margarodidae)的蚧虫(scale)、源自网蝽科(Tingidae)的网蝽(lace bug)、源自长蝽科(Lygaeidae)的麦长蝽(chinch bug)(例如,麦长蝽属(Blissus spp.))及其他宽盾蝽(seed bug)、源自沫蝉科(Cercopidae)的沫蝉(spittlebug)、源自星椿象科(Pyrrhocoridae)的红虫(red bug)及棉蝽象(cotton stainer)。亦包括蜱螨(Acari)(螨)目的成虫及幼虫,诸如叶螨科(Tetranychidae)的叶螨(spider mite)及红螨(red mite)(例如,苹果红蜘蛛(European red mite、Panonychus ulmi Koch)、二斑叶螨(two spotted spider mite、Tetranychus urticae Koch)、迈叶螨(McDaniel mite、Tetranychus mcdanieli McGregor))、细须螨科(Tenuipalpidae)的短须螨(flat mite)(例如,柑橘短须螨(citrus flat mite、Brevipalpus lewisi McGregor))、瘿螨科(Eriophyidae)的锈螨(rust mite)及芽蜱(bud mite)及其他食叶螨及对于人类及动物健康状态重要的螨,亦即表面皮螨科(Epidermoptidae)的尘螨(dust mite)、硬蜱科(Ixodidae)的蜱(tick)(例如,鹿蜱(deer tick、Ixodes scapularis Say)、全环硬蜱(Australian paralysis tick、Ixodes holocyclus Neumann)、美洲犬蜱(American dog tick、Dermacentor variabilis Say)、孤星蜱(lone star tick、Amblyomma americanum Linnaeus)及痒螨科(Psoroptidae)、蒲螨科(Pyemotidae)及疥螨科(Sarcoptidae)的疥螨(scab mite、itch mite);直翅目(Orthoptera)的成虫及幼虫,其包括蚱蜢(grasshopper)、蝗虫(locust)及蟋蟀(cricket)(例如,迁徙蚱蜢(migratory grasshopper)(例如,血黑蝗(Melanoplus sanguinipes Fabricius)、殊种蝗(M.differentialis Thomas))、美洲蚱蜢(American grasshopper)(例如,美洲蚱蜢(Schistocerca Americana Drury))、沙漠蝗虫(desert locust、Schistocerca gregaria Forskal)、飞蝗(migratory locust、Locusta migratoria Linnaeus)、家蟋蟀(house cricket、Acheta domesticus Linnaeus)、蝼蛄(mole cricket、蝼蛄属(Gryllotalpa spp.));双翅目(Diptera)的成虫及幼虫,其包括潜叶蛾(leafminer)、蠓(midge)、果蝇(果实蝇科(Tephritidae))、果蝇(例如,瑞典麦秆蝇(Oscinella frit Linnaeus))、土壤蛆(soil maggot)、家蝇(house fly)(例如,家蝇(Musca domestica Linnaeus))、较小家蝇(lesser house fly)(例如,夏厕蝇(Fannia canicularis Linnaeus)、黄厕蝇(F.femoralis Stein))、厩腐蝇(stable fly)(例如,厩螯蝇(Stomoxys calcitrans Linnaeus))、秋家蝇(face fly)、角蝇(horn fly)、绿头苍蝇(blow fly)(例如,金蝇属(Chiysomya spp.)、黑花蝇属(Phormia spp.)),及其他蝇类有害动物、马蝇(horse fly)(例如,虻属(Tabanus spp.))、肤蝇(bot fly)(例如,胃蝇属(Gastrophilus spp.)、狂蝇属(Oestrus spp.))、牛皮蝇(cattle grub)(例如皮蝇属(Hypoderma spp.))、斑虻(deer fly)(例如,斑虻属(Chrysops spp.))、羊蜱蝇(ked)(例如,绵羊虱蝇(Melophagus ovinus Linnaeus))及其他短角亚目(Brachycera)、蚊子(mosquitoe)(例如,伊蚊属(Aedes spp.)、按蚊属(Anopheles spp.)、库蚊属(Culex

spp.))、墨蝇(black fly)(例如,原蚋属(Prosimulium spp.)、蚋属(Simulium spp.))、蠓(biting midge)、白蛉(sand fly)、尖眼蕈蚊(sciarid)及其他长角亚目(Nematocera);缨翅目(Thysanoptera)的成虫及幼虫,其包括烟蓟马(onion thrip、Thrips tabaci Lindeman)及其他食叶蓟马;包括蚁科(Formicidae)的蚂蚁的膜翅目(Hymenoptera)的害虫,该蚂蚁例如为红弓背蚁(red carpenter ant、Camponotus ferrugineus Fabricius)、黑弓背蚁(black carpenter ant、Camponotus pennsylvanicus De Geer)、小黄家蚁(Pharaoh ant、Monomorium pharaonis Linnaeus)、小火蚁(little fire ant、Wasmannia auropunctata Roger)、火蚁(fire ant、Solenopsis geminata Fabricius)、入侵红火蚁(red imported fire ant、Solenopsis invicta Buren)、阿根廷蚁(Argentine ant、Iridomyrmex humilis Mayr)、狂蚁(crazy ant、Paratrechina longicornis Latreille)、铺道蚁(pavement ant、Tetramorium caespitum Linnaeus)、玉米田蚁(cornfield ant、Lasius alienus Fδrster)及臭家蚁(odorous house ant、Tapinoma sessile Say)。其他膜翅目包括蜜蜂(包括木蜂(carpenter bee))、大黄蜂(hornet)、胡蜂(yellow jacket)及黄蜂(wasp);等翅目(Isoptera)的害虫,其包括黄胸散白蚁(eastern subterranean termite、Reticulitermes flavipes Kollar)、西方散白蚁(western subterranean termite、Reticulitermes hesperus Banks)、台湾乳白蚁(Formosan subterranean termite、Coptotermes formosanus Shiraki)、西印度干木白蚁(West Indian drywood termite、Incisitermes immigrans Snyder)及其他具有经济上重要性的白蚁;缨尾目(Thysanura)的害虫,诸如蠹虫(silverfish、Lepisma saccharina Linnaeus)及家衣鱼(firebrat、Thermobia domestica Packard);食毛目(Mallophaga)的害虫且包括头虱(head louse、Pediculus humanus capitis De Geer)、体虱(body louse、Pediculus humanus Linnaeus)、鸡体虱(chicken body louse、Menacanthus stramineus Nitszch)、犬啮毛虱(dog biting louse、Trichodectes canis De Geer)、绒毛虱(fluff louse、Goniocotes gallinae De Geer)、羊体虱(sheep body louse、Bovicola ovis Schrank)、短吻牛虱(short-nosed cattle louse、Haematopinus eurysternus Nitzsch)、长吻牛虱(long-nosed cattle louse、Linognathus vituli Linnaeus)及其他攻击人及动物的吮吸及嚼咽寄生羽虱(parasitic lice);蚤目(Siphonoptera)的虫害,其包括东方鼠蚤(oriental rat flea、Xenopsylla cheopis Rothschild)、猫蚤(cat flea、Ctenocephalides felis Bouche)、犬蚤(dog flea、Ctenocephalides canis Curtis)、鸡蚤(hen flea、Ceratophyllus gallinae Schrank)、吸着蚤(sticktight flea、Echidnophaga gallinacea Westwood)、人蚤(human flea、Pulex irritans Linnaeus)及折磨哺乳动物及鸟的其他跳蚤。所涵盖的其他节肢动物害虫包括:蜘蛛目(Araneae)的蜘蛛,诸如褐丝蛛(brown recluse spider、Loxosceles reclusa Gertsch及Mulaik)及黑寡妇蜘蛛(black widow spider、Latrodectus mactans Fabricius)及蚰蜒目(Scutigeromorpha)的蜈蚣,诸如普通居家蜈蚣(house centipede、Scutigera coleoptrata Linnaeus)。本公开的化合物亦对线虫纲、多节绦虫纲、吸虫纲及棘头纲的成员有效,其成员包括圆线虫目(Strongylida)、蛔目(Ascaridida)、尖尾目(Oxyurida)、小杆目(Rhabditida)、旋尾目(Spirurida)及刺嘴目(Enoplida)的经济上重要的成员,诸如(但不限于)经济上重要的农业有害动物(亦即根结线虫(Meloidogyne)属的根癌线虫(root

knot nematode)、根腐线虫(Pratylenchus)属的腐蚀线虫(lesion nematode)、残根线虫(Trichodorus)属的残根线虫(stubby root nematode)等)及动物及人的健康有害动物(亦即所有经济上重要的吸虫、绦虫及蛔虫,诸如马的普通圆形线虫(Strongylus vulgaris)、狗的犬蛔虫(Toxocara canis)、绵羊的捻转血矛线虫(Haemonchus contortus)、犬的犬心丝虫(Dirofilaria immitis Leidy)、马的叶状裸头绦虫(Anoplocephala perfoliata)、反刍动物的肝吸虫(Fasciola hepatica Linnaeus)等)。

[0309] 本发明的化合物对同翅目(Homoptera)的害虫显示出尤其高的活性,包括:豌豆蚜(Acyrthosiphon pisum Harris、pea aphid)、豇豆蚜(Aphis craccivora Koch、cowpea aphid)、黑豆蚜(Aphis fabae Scopoli、black bean aphid)、棉蚜(Aphis gossypii Glover、cotton aphid、melon aphid)、苹果蚜(Aphis pomi De Geer、apple aphid)、锈线菊蚜(Aphis spiraecola Patch、spirea aphid)、马铃薯蚜(Aulacorthum solani Kaltenbach、foxglove aphid)、草莓毛管蚜(Chaetosiphon fragaefolii Cockerell、strawberry aphid)、俄罗斯麦蚜(Diuraphis noxia Kurdjumov/Mordvilko、Russian wheat aphid)、玫瑰苹果蚜(Dysaphis plantaginea Paaserini、rosy apple aphid)、苹果绵蚜(Eriosoma lanigerum Hausmann、woolly apple aphid)、桃大尾蚜(Hyalopterus pruni Geoffroy、mealy plum aphid)、萝卜蚜(Lipaphis erysimi Kaltenbach、turnip aphid)、麦无网长管蚜(Metopolophium dirrhodum Walker、cereal aphid)、大戟长管蚜(Macrosiphum euphorbiae Thomas、potato aphid)、桃蚜(Myzus persicae Sulzer、peach-potato aphid、green peach aphid)、莴苣蚜(Nasonovia ribisnigri Mosley、lettuce aphid)、瘿绵蚜属(Pemphigus spp.)(根蚜(root aphid)及瘿蚜(gall aphid))、玉米叶蚜(Rhopalosiphum maidis Fitch、corn leaf aphid)、禾谷缢管蚜(Rhopalosiphum padi Linnaeus、bird cherry-oat aphid)、麦二叉蚜(Schizaphis graminum Rondani、greenbug)、麦长管蚜(Sitobion avenae Fabricius、English grain aphid)、苜蓿彩斑蚜(Therioaphis maculate Buckton、spotted alfalfa aphid)、桔二叉蚜(Toxoptera aurantii Boyer de Fonscolombe、black citrus aphid)及褐柑橘蚜(Toxoptera citricida Kirkaldy、brown citrus aphid);球蚜属(Adelges spp.)(球蚜(adelgid));美洲山核桃根瘤蚜(Phylloxera devastatrix Pergande、pecan phylloxera);烟草粉虱(Bemisia tabaci Gennadius、tobacco whitefly、sweetpotato whitefly)、银叶粉虱(Bemisia argentifolii Bellows及Perring、silverleaf whitefly)、柑橘粉虱(Dialeurodes citri Ashmead、citrus whitefly)及温室白粉虱(Trialeurodes vaporariorum Westwood、greenhouse whitefly);马铃薯叶蝉(Empoasca fabae Harris、potato leafhopper)、小褐飞虱(Laodelphax striatellus Fallen、smaller brown planthopper)、紫菀叶蝉(Macrolestes quadrilineatus Forbes、aster leafhopper)、绿叶蝉(Nephotettix cinticeps Uhler、green leafhopper)、稻叶蝉(Nephotettix nigropictus Stal、rice leafhopper)、褐飞虱(Nilaparvata lugens Stal、brown planthopper)、玉米飞虱(Peregrinus maidis Ashmead、corn planthopper)、白背飞虱(Sogatella furcifera Horvath、white-backed planthopper)、稻飞虱(Sogatodes orizicola Muir、rice delphacid)、苹果白叶蝉(Typhlocyba pomaria McAfee、white apple leafhopper)、葡萄叶蝉属(Erythroneoura spp.)(葡萄叶蝉(grape leafhopper));

周期蝉(Magicidada septendecim Linnaeus、periodical cicada);绵团蚧(Icerya purchasi Maskell、cottony cushion scale)、梨枝圆盾蚧(Quadraspidiotus perniciosus Comstock、San Jose scale);柑橘粉蚧(Planococcus citri Risso、citrus mealybug);康氏粉蚧属(Pseudococcus spp.)(其他粉蚧复合体);梨木虱(Cacopsylla pyricola Foerster、pear psylla)、柿木虱(Trioza diospyri Ashmead、persimmon psylla)。本发明的化合物对鳞翅目(Lepidoptera)成员也有显著的商业活性,例如棉叶波纹叶蛾(Alabama argillacea Hubner、cotton leaf worm)、果树黄卷蛾(Archips argyrospila Walker、fruit tree leaf roller)、欧洲卷叶蛾(A.rosana Linnaeus、European leaf roller)及其他卷蛾属(Archips species)、水稻二化螟(Chilo suppressalis Walker、rice stem borer)、稻纵卷叶螟(Cnaphalocrosis medinalis Guenee、rice leaf roller)、玉米根结网毛虫(Crambus caliginosellus Clemens、corn root webworm)、莓系牧草结网毛虫(Crambus teterrellus Zincken、bluegrass webworm)、苹果蠹蛾(Cydia pomonella Linnaeus、codling moth)、埃及金刚钻(Earias insulana Boisduval、spiny bollworm)、斑纹螟蛉(Earias vittella Fabricius、spotted bollworm)、美洲螟蛉(Helicoveipa armigera Hübner、American bollworm)、玉米穗虫(Helicoverpa zea Boddie、corn earworm)、烟草夜蛾(Heliothis virescens Fabricius、tobacco budworm)、草地结网毛虫(Herpetogramma licarsisalis Walker、sod webworm)、葡萄浆果小卷蛾(Lobesia botrana Denis and Schiffermüller、grape berry moth)、红铃虫(Pectinophora gossypiella Saunders、pink bollworm)、柑橘潜叶蛾(Phyllocnistis citrella Stainton、citrus leafminer)、大纹白蝶(Pieris brassicae Linnaeus、large white butterfly)、小纹白蝶(Pieris rapae Linnaeus、small white butterfly)、小菜蛾(Plutella xylostella Linnaeus、diamondback moth)、甜菜夜蛾(Spodoptera exigua Hubner、beet armyworm)、斜纹夜蛾(Spodoptera litura Fabricius、tobacco cutworm、cluster caterpillar)、秋季夜蛾(Spodoptera frugiperda J.E.Smith、fall armyworm)、粉纹夜蛾(Trichoplusia ni Hübner、cabbage looper)及西红柿斑潜蝇(Tuta absoluta Meyrick、tomato leafminer)。

[0310] 该化合物对半翅目(Hemiptera)成员具有活性,包括:绿蝽象(Acrosternum hilare Say、green stink bug)、南瓜缘蝽(Anasa tristis De Geer、squash bug)、麦长蝽(Blissus leucopterus leucopterus Say、chinch bug)、绵网蝽(Corythuca gossypii Fabricius、cotton lace bug)、马铃薯蝽(Cyrtopeltis modesta Distant、tomato bug)、棉蝽象(Dysdercus suturellus Herrich-S chaffer、cotton stainer)、褐蝽象(Euchistus servus Say、brown stink bug)、一斑蝽象(Euchistus variolarius Palisot deBeauvois、one-spotted stink bug)、蝽象的复合体属(Graptósthetus spp.)(宽盾蝽的复合体)、松树缘蝽象(Leptoglossus corculus Say、leaf-footed pine seed bug)、牧草盲蝽(Lygus lineolaris Palisot de Beauvois、tarnished plant bug)、稻绿蝽(Nezara viridula Linnaeus、southern green stink bug)、稻蝽象(Oebalus pugnax Fabricius、rice stink bug)、大乳草属植物蝽(Oncopeltus fasciatus DaEas、large milkweed bug)、棉跳盲蝽(Pseudatomoscelis seriatus Reuter、cotton fleahopper)。

[0311] 由本发明的化合物控制的其他昆虫目包括:缨翅目(Thysanoptera)(例如,西花蓟

马(Frankliniella occidentalis Pergande、western flower thrips)、柑橘蓟马(*Scirthothrips* citri Moulton、citrus thrips)、黄豆蓟马(Sericothrips variabilis Beach、soybean thrips)及葱蓟马(Thrips tabaci Lindeman、onion thrips));及鞘翅目(Coleoptera)(例如,马铃薯甲虫(Leptinotarsa decemLineata Say、Colorado potato beetle)、墨西哥豆甲(Epilachna varivestis Mulsant、Mexican bean beetle)及扣甲(Agriotes)属、山扣甲(Athous)属或金针虫(Limonius)属的线虫)。

[0312] 尤其是,式(I)化合物、其N-氧化物、其立体异构物、其多晶型物及其盐特别适合用于有效对抗以下害虫:源自鳞翅目(Lepidoptera)的昆虫,例如:小地老虎(Agrotis ypsilon)、黄地老虎(Agrotis segetum)、棉叶波纹叶蛾(Alabama argillacea)、黎豆夜蛾(Anticarsia gemmatalis)、苹实巢蛾(Argyresthia conjugella)、枭蛾(Autographa gamma)、松树尺蠖(Bupalus piniarius)、后黄小卷蛾(Cacoecia murinana)、棉褐带卷蛾(Capua reticulana)、尺蠖蛾(Cheimatobia brumata)、云杉卷叶蛾(Choristoneura fumiferana)、西方云杉蚜虫(Choristoneura occidentalis)、美洲黏虫(Cirphis unipuncta)、苹果蠹蛾(Cydia pomonella)、欧洲松毛虫(Dendrolimus pini)、瓜野螟(Diaphania nitidalis)、巨座玉米螟(Diatraea grandiosella)、棉斑实蛾(Earias insulana)、方棉铃虫(Earias vittella)、小玉米螟(Elasmopalpus lignosellus)、葡萄螟蛾(Eupoecilia ambiguella)、欧洲松枝蛾(Evetria bouliana)、粒肤地老虎(Feltia subterranea)、大蜡螟(Galleria mellonella)、李小食心虫(Grapholita funebrana)、梨小食心虫(Grapholita molesta)、蕃茄夜蛾(Helicoverpa armigera)、美洲烟夜蛾(Helicoverpa virescens)、棉铃虫(Helicoverpa zea)、菜螟(Hellula undalis)、灰裙尺蠖蛾(Hibernia defoliaria)、美国白蛾(Hyphantria cunea)、苹果巢蛾(Hyponomeuta malinellus)、西红柿蠹蛾(Keiferia lycopersicella)、铁杉尺蠖(Lambdina fiscellaria)、甜菜夜蛾(Laphygma exigua)、咖啡潜叶蛾(Leucoptera coffeella)、旋纹潜叶蛾(Leucoptera scitella)、斑点潜叶蛾(Lithocolletis blancardella)、葡萄浆果小卷蛾(Lobesia botrana)、黄绿绦螟(Loxostege sticticalis)、茄白翅野螟蛾(Leucinodes orbonalis)、舞毒蛾(Lymantria dispar)、僧尼毒蛾(Lymantria monacha)、窄翅潜叶(Lyonetia clerkella)、天幕毛虫(Malacosoma neustria)、甘蓝夜蛾(Mamestra brassicae)、花旗松毒蛾(Orgyia pseudotsugata)、欧洲玉米螟(Ostrinia nubilalis)、冬夜蛾(Panolis flammea)、红铃虫(Pectinophora gossypiella)、杂色地老虎(Peridroma saucia)、圆掌舟蛾(Phalera bucephala)、马铃薯块茎蛾(Phthorimaea operculella)、橘细潜蛾(Phyllocnistis citrella)、大菜粉蝶(Pieris brassicae)、苜蓿绿夜蛾(Plathypena scabra)、小菜蛾(Plutella xylostella)、大豆夜蛾(Pseudoplusia includens)、松梢卷叶蛾(Rhyacionia frustrana)、三化螟(Scirpophaga incertulas)、西红柿潜叶蛾(Scrobipalpula absoluta)、麦蛾(Sitotroga cerealella)、葡萄长须卷叶蛾(Sparganothis pilleriana)、草地黏虫(Spodoptera frugiperda)、灰翅夜蛾(Spodoptera littoralis)、斜纹夜蛾(Spodoptera litura)、草地贪夜蛾(Spodoptera exigua)、松异带蛾(Thaumatopoea pityocampa)、栎绿卷叶蛾(Tortrix viridana)、粉纹夜蛾(Trichoplusia ni)及云杉小卷叶蛾(Zeiraphera canadensis);以及

[0313] 甲虫类(鞘翅目(Coleoptera)),例如梨长吉丁(Agrilus sinuatus)、具条叩甲

(Agriotes lineatus)、黯金针虫(Agriotes obscurus)、六月金龟(Amphimallus solstitialis)、穿孔蛀虫(Anisandrus dispar)、棉铃象甲(Anthonomus grandis)、苹果花象甲(Anthonomus pomorum)、尤弗里特跳甲(Aphthona euphoridae)、红尾叩头虫(Athous haemorrhoidalis)、线形隐食甲(Atomaria linearis)、大松小蠹(Blastophagus piniperda)、天幕枯叶蛾(Blitophaga undata)、蚕豆象(Bruchus rufimanus)、豌豆象(Bruchus pisorum)、扁豆象(Bruchus lentis)、苹果卷叶象甲(Byctiscus betulae)、甜菜大龟甲(Cassida nebulosa)、豆叶甲(Cerotoma trifurcata)、金花金龟(Cetonia aurata)、甘蓝荚象甲(Ceuthorrhynchus assimilis)、茎象鼻虫(Ceuthorrhynchus napi)、甜菜胫跳甲(Chaetocnema tibialis)、烟草金针虫(Conoderus vespertinus)、天冬负泥甲(Crioceris asparagi)、叩头虫亚种(Ctenicera ssp.)、长角叶甲(Diabrotica longicornis)、黄瓜半星叶甲(Diabrotica semipunctata)、十二星瓜叶甲(Diabrotica undecimpunctata)、巴西叶甲(Diabrotica speciosa)、玉米根叶甲(Diabrotica virgifera)、墨西哥豆瓢虫(Epilachna varivestis)、烟草跳甲(Epitrix hirtipennis)、棉钻心虫(Eutinobothrus brasiliensis)、松树象甲(Hylobius abietis)、埃及苜蓿象甲(Hypera brunneipennis)、苜蓿叶象甲(Hypera postica)、云杉八齿小蠹(Ips typographus)、具条负泥虫(Lema bilineata)、黑角负泥虫(Lema melanopus)、马铃薯甲虫(Leptinotarsa decemLineata)、甜菜金针虫(Limonius californicus)、稻象甲(Lissorhoptrus oryzophilus)、棉线虫(Melanotus communis)、油菜露尾甲(Meligethes aeneus)、忽布鳃角金龟(Melolontha hippocastani)、西方五月鳃金龟(Melolontha)、稻负泥虫(Oulema oryzae)、黑藤象甲(Ortiorrhynchus sulcatus)、草莓根象甲(Otiorrhynchus ovatus)、辣根猿叶甲(Phaedon cochleariae)、梨切叶象(Phyllobius pyri)、油菜蓝跳甲(Phyllotreta chrysocephala)、金龟子属(Phyllophaga sp.)、庭园丽金龟(Phyllopertha horticola)、芜菁淡足跳甲(Phyllotreta nemorum)、黄曲条跳甲(Phyllotreta striolata)、日本丽金龟(Popillia japonica)、豌豆叶象甲(Sitona lineatus)及谷象(Sitophilus granaria);苍蝇、蚊子(双翅目(Diptera)),例如埃及伊蚊(Aedes aegypti)、白纹伊蚊(Aedes albopictus)、刺扰伊蚊(Aedes vexans)、墨西哥橘实蝇(Anastrepha ludens)、五斑按蚊(Anopheles maculipennis)、库态按蚊(Anopheles crucians)、淡色按蚊(Anopheles albimanus)、冈比亚按蚊(Anopheles gambiae)、费氏按蚊(Anopheles freeborni)、白踝按蚊(Anopheles leucosphyrus)、微小按蚊(Anopheles minimus)、四斑按蚊(Anopheles quadrimaculatus)、红头丽蝇(Calliphora vicina)、地中海实蝇(Ceratitis capitata)、蛆症金蝇(Chrysomya bezziana)、美洲金蝇(Chrysomya hominivorax)、稻金蝇(Chrysomya macellaria)、鹿蝇(Chrysops discalis)、黄赭色斑虻(Chrysops silacea)、大西洋斑虻(Chrysops atlanticus)、羊旋皮蝇(Cochliomyia hominivorax)、高粱瘿蚊(Contarinia sorghicola)、盾波蝇(Cordylobia anthropophaga)、毛库蠓(Culicoides furens)、五带淡色库蚊(Culex pipiens)、黑须库蚊(Culex nigripalpus)、致倦库蚊(Culex quinquefasciatus)、媒库蚊(Culex tarsalis)、纯色脉毛蚊(Culiseta inornata)、黑尾脉毛蚊(Culiseta melanura)、瓜实蝇(Dacus cucurbitae)、油橄榄实蝇(Dacus oleae)、芸苔荚瘿蚊(Dasineura brassicae)、葱地种蝇(Delia antique)、麦地种蝇(Delia coarctata)、灰地种蝇(Delia platura)、甘蓝地种蝇

(Delia radicum)、人肤蝇(Dermatobia hominis)、黄腹厩蝇(Fannia canicularis)、三点禾蝇(Geomyza Tripunctata)、大马胃蝇(Gasterophilus intestinalis)、刺舌蝇(Glossina morsitans)、须舌蝇(Glossina palpalis)、引舌蝇(Glossina fuscipes)、胶舌蝇(Glossina tachinoides)、骚扰角蝇(Haematobia irritans)、鞍形瘿蚊(Haplodiplosis equestris)、潜蝇属(Hippelates spp.)、种蝇(Hylemyia platura)、纹皮蝇(Hypoderma lineata)、勒蠓(Leptoconops torrens)、美洲斑潜蝇(Liriomyza sativae)、非洲菊斑潜蝇(Liriomyza trifolii)、山羊绿蝇(Lucilia caprina)、铜绿蝇(Lucilia cuprina)、丝光绿蝇(Lucilia sericata)、白杨花蝇(Lycoria pectoralis)、曼蚊(Mansonia titillanus)、黑森麦杆蝇(Mayetiola destructor)、秋家蝇(Musca autumnalis)、家蝇(Musca domestica)、厩腐蝇(Muscina stabulans)、羊鼻蝇(Oestrus ovis)、禾蝇(Opomyza florum)、瑞典麦秆蝇(Oscinella frit)、甜菜潜叶蝇(Pegomya hysocyami)、葱蝇(Phorbia antiqua)、甘蓝蝇(Phorbia brassicae)、麦蝇(Phorbia coarctata)、银足白蛉(Phlebotomus argentipes)、哥伦比亚鳞蚊(Psorophora columbiae)、胡萝卜茎蝇(Psila rosae)、异色鳞蚊(Psorophora discolor)、混合墨蚊(Prosimulium mixtum)、樱桃实蝇(Rhagoletis cerasi)、苹果实蝇(Rhagoletis pomonella)、红尾肉蝇(Sarcophaga haemorrhoidalis)、肉蝇属(Sarcophaga spp.)、带蚋(Simulium vittatum)、厩刺蝇(Stomoxys calcitrans)、牛虻(Tabanus bovinus)、黑虻(Tabanus atratus)、具带马虻(Tabanus lineola)、拟原虻(Tabanus similis)、普通大蚊(Tipula oleracea)及欧洲大蚊(Tipula paludosa);白蚁类(termites)(等翅目(Isoptera)),例如欧洲木白蚁(Calotermes flavicollis)、普通白蚁(Leucotermes flavipes)、金黄异白蚁(Heterotermes aureus)、黄胸散白蚁(Reticulitermes flavipes)、南方散白蚁(Reticulitermes virginicus)、南欧网纹白蚁(Reticulitermes lucifugus)、沙同散白蚁(Reticulitermes santonensis)、草地散白蚁(Reticulitermes grassei)、金花白蚁(Termes natalensis)及家白蚁(Coptotermes formosanus);蟑螂(蜚蠊目(Blattaria Blattodea)),例如德国小蠊(Blattella germanica)、亚洲小蠊(Blattella asahinae)、美洲大蠊(Periplaneta americana)、日本大蠊(Periplaneta japonica)、褐色大蠊(Periplaneta brunnea)、烟色大蠊(Periplaneta fuligginosa)、澳洲大蠊(Periplaneta australasiae)及东方蜚蠊(Blatta orientalis);蚂蚁、蜜蜂、黄蜂、锯蝇(膜翅目(Hymenoptera)),例如新疆菜叶蜂(Athalia rosae)、切叶蚁(Atta cephalotes)、卡培古鲁切叶蚁(Atta capiguara)、热带切叶蚁(Atta cephalotes)、光亮切叶蚁(Atta laevigata)、强壮切叶蚁(Atta robusta)、南美切叶蚁(Atta sexdens)、德州切叶蚁(Atta texana)、举尾蚁属(Crematogaster spp.)、小长角叶蜂(Hoplocampa minuta)、欧洲苹果长角叶蜂(Hoplocampa testudinea)、毛蚁(Lasius niger)、厨蚁(Monomorium pharaonis)、热带火蚁(Solenopsis geminata)、红火蚁(Solenopsis invicta)、黑火蚁(Solenopsis richteri)、加州火蚁(Solenopsis xyloni)、红收获蚁(Pogonomyrmex barbatus)、加州收获蚁(Pogonomyrmex californicus)、大头蚁(Pheidole megacephala)、西方蚁蜂(Dasymutilla occidentalis)、熊蜂属(Bombus spp.)、黄胡蜂(Vespula squamosa)、常见黄胡蜂(Paravespula vulgaris)、树黄胡蜂(Paravespula pennsylvanica)、德国黄胡蜂(Paravespula germanica)、白斑脸黄胡蜂(Dolichovespula maculata)、黄边胡蜂(Vespa

crabro)、赭色马蜂(Polistes rubiginosa)、佛罗里达弓背蚁(Camponotus floridanus)及阿根廷蚁(Linepithema humile);蟋蟀、蚱蜢、蝗虫(直翅目(Orthoptera)),例如家蟋蟀(Acheta domestica)、欧洲蝼蛄(Gryllotalpa)、飞蝗(Locusta migratoria)、双带蚱蜢(Melanoplus bivittatus)、赤腿蚱蜢(Melanoplus femurrubrum)、墨西哥蚱蜢(Melanoplus mexicanus)、迁徙蚱蜢(Melanoplus sanguinipes)、落矶山蚱蜢(Melanoplus spretus)、红翅蝗(Nomadacris septemfasciata)、美洲蚱蜢(Schistocerca americana)、沙漠蝗虫(Schistocerca gregaria)、摩洛哥戟纹蝗(Dociostaurus maroccanus)、温室蟋螽(Tachycines asynamorus)、塞内加尔小车蝗(Oedaleus senegalensis)、臭腹腺蝗(Zonozerus variegatus)、斑角蔗蝗(Hieroglyphus daganensis)、印度黄檀蝗(Kraussaria angulifera)、意大利蝗(Calliptamus italicus)、澳洲疫蝗(Chortoicetes terminifera)及南非蝗(Locustana pardalina);蛛形目(Araneida),例如黑寡妇蜘蛛(Latrodectus mactans)及棕色遁蛛(Loxosceles reclusa);跳蚤(蚤目(Siphonaptera)),例如猫栉头蚤(Ctenocephalides felis)、犬栉首蚤(Ctenocephalides canis)、印度鼠蚤(Xenopsylla cheopis)、人蚤(Pulex irritans)、潜蚤(Tunga penetrans)及条纹鼠蚤(Nosopsyllus fasciatus);蠹虫(silverfish,Lepisma saccharina)及家衣鱼(firebrat,Thermobia domestica);蜈蚣(唇足纲(Chilopoda)),例如地中海蚰蜒(Scutigera oleoptrata);马陆(millipedes)(倍足纲(Diplopoda)),例如千足虫属(Narceus spp.);地蜈蚣(earwigs)(革翅目(Dermaptera)),例如欧洲地蜈蚣(forficula auricularia);虱类(lice)(虱目(Phthiraptera)),例如人头虱(Pediculus humanus capitis)、人体虱(Pediculus humanus corporis)、耻阴虱(Pthirus pubis)、牛虱(Haematopinus eurysternus)、猪虱(Haematopinus suis)、牛颚虱(Linognathus vituli)、牛鸟虱(Bovicola bovis)、鸡虱(Menopon allinae)、大鸡虱(Menacanthus stramineus)及小短鼻牛虱(Solenopotes capillatus);弹尾目(Collembola)(跳虫(springtails)),例如棘跳虫亚种(Onychiurus ssp.)。

[0314] 这些化合物也适用于控制线虫类:植物寄生线虫,例如根结线虫类(root knot nematodes)、北方根结线虫(Meloidogyne hapla)、南方根结线虫(Meloidogyne incognita)、爪哇根结线虫(Meloidogyne javanica)及其他根结线虫属(Meloidogyne species);胞囊线虫类(cyst-forming nematodes)、黄金线虫(Globodera rostochiensis)及其他球形胞囊属(Globodera species);小麦胞囊线虫(Heterodera avenae)、大豆胞囊线虫(Heterodera glycines)、甜菜胞囊线虫(Heterodera schachtii)、三叶草胞囊线虫(Heterodera trifolii)及其他胞囊线虫属(Heterodera species);种瘤线虫类(Seed gall nematodes),粒线虫属(Anguina species);茎叶线虫类(Stem and foliar nematodes),滑刃线虫属(Aphelenchoides species);螯刺线虫类(Sting nematodes),刺线虫(Belonolaimus longicaudatus)及其他刺线虫属(Belonolaimus species);松树线虫类(Pine nematodes),松材线虫(Bursaphelenchus xylophilus)及其他伞滑刃属(Bursaphelenchus species);环形线虫类(Ring nematodes),环线虫属(Criconema species)、环纹线虫种(Criconemella species)、拟环线虫属(Criconemoides species)、中环线虫种(Mesocriconema species);茎线虫类(Stem and bulb nematodes),马铃薯腐败线虫(Ditylenchus destructor)、玉米茎线虫(Ditylenchus dipsaci)及其他茎线虫种

(Ditylenchus species);锥线虫类(Awl nematodes),锥线虫属(Dolichodorus species);螺旋线虫(Spiral nematodes),多带螺旋线虫(Helicotylenchus multicinctus)及其他螺旋线虫属(Helicotylenchus species);鞘线虫类(Sheath and sheathoid nematodes),鞘线虫属(Hemicycliophora)及拟鞘线虫(Hemicriconemoides);稻根线虫属(Hirshmanniella species);矛形线虫类(Lance nematodes),冠线虫属(Hoploaimus species);假根结线虫类(false rootknot nematodes),假根结线虫属(Nacobbus species);针线虫类(Needle nematodes),细长针线虫(Longidorus elongatus)及其他长针线虫属(Longidorus species);拟垫刃线虫类(Lesion nematodes),加州根腐线虫(Pratylenchus neglectus)、北方根腐线虫(Pratylenchus penetrans)、弯曲根腐线虫(Pratylenchus curvitatus)、损伤根腐线虫(Pratylenchus goodeyi)及其他根腐线虫属(Pratylenchus species);穿孔线虫类(Burrowing nematodes),穿孔线虫(Radopholus similis)及其他穿孔线虫属(Radopholus species);肾形线虫类(Reniform nematodes),旋形线虫(Rotylenchus robustus)及其他盘旋线虫属(Rotylenchus species);盾线虫种(Scutellonema species);残根线虫类(Stubby root nematodes),克伯氏残根线虫(Trichodorus primitivus)及其他残根线虫属(Trichodorus species)、拟残根线虫种(Paratrichodorus species);矮化线虫类(Stunt nematodes),烟草矮化线虫(Tylenchorhynchus claytoni)、不定矮化线虫(Tylenchorhynchus dubius)及其他矮化线虫属(Tylenchorhynchus species);柑桔线虫类(Citrus nematodes),垫刃线虫属(Tylenchulus species);剑线虫类(Dagger nematodes),剑线虫属(Xiphinema species);及其他植物寄生线虫种。

[0315] 式(I)化合物及其盐也对控制蛛形类(arachnids)(蛛形纲(Arachnoidea))有效,诸如蜱螨目(Acarina),例如隐喙蜱科(Argasidae)、蜱科(Ixodidae)及疥螨科(Sarcoptidae),诸如美洲花蜱(Amblyomma americanum)、彩饰花蜱(Amblyomma variegatum)、波斯隐喙蜱(Argas persicus)、具环方头蜱(Boophilus annulatus)、无纹牛蜱(Boophilus decoloratus)、微小牛蜱(Boophilus microplus)、森林革蜱(Dermacentor silvarum)、长喙璃眼蜱(Hyalomma truncatum)、羊硬蜱(Ixodes ricinus)、红硬蜱(Ixodes rubicundus)、喙蜱(Ornithodorus moubata)、耳残喙蜱(Otobius megnini)、鸡皮刺螨(Dermanyssus gallinae)、羊痒螨(Psoroptes ovis)、具尾扇头蜱(Rhipicephalus appendiculatus)、双寄主壁虱(Rhipicephalus evertsi)、疥螨(Sarcoptes scabiei);及瘿螨属(Eriophyidae spp.),诸如苹刺瘿螨(Aculus schlechtendali)、橘锈螨(Phyllocoptrata oleivora)及柑桔瘿螨(Eriophyes sheldoni);跗线螨属(Tarsonemidae spp.),诸如仙客来螨(Phytonemus pallidus)及多食跗线螨(Polyphagotarsonemus latus);细须螨属(Tenuipalpidae spp.),诸如紫伪叶螨(Brevipalpus phoenicis);叶螨属(Tetranychidae spp.),诸如朱砂叶螨(Tetranychus cinnabarinus)、神泽氏叶螨(Tetranychus kanzawai)、太平洋红叶螨(Tetranychus pacificus)、棉红蜘蛛(Tetranychus telarius)及棉叶螨(Tetranychus urticae)、苹果红蜘蛛(Panonychus ulmi)、橘全爪螨(Panonychus citri)及草地小爪螨(oligonychus pratensis)。

[0316] 在又一实施例中,本发明提供式(I)化合物,其可做为控制昆虫的活性且有用的化合物,昆虫是选自吸吮或刺穿昆虫,例如来自缨翅目(Thysanoptera)、双翅目(Diptera)及

半翅目(Hemiptera)的昆虫,尤其是以下物种:

[0317] 缨翅目(Thysanoptera):烟草褐蓟马(Frankliniella fusca)、西花蓟马(Frankliniella occidentalis)、花蓟马(Frankliniella tritici)、橘实蓟马(Scirtothrips citri)、稻蓟马(Thrips oryzae)、南黄蓟马(Thrips palmi)及烟蓟马(Thrips tabaci);

[0318] 双翅目(Diptera),例如:埃及伊蚊(Aedes aegypti)、白纹伊蚊(Aedes albopictus)、刺扰伊蚊(Aedes vexans)、墨西哥橘实蝇(Anastrepha ludens)、五斑按蚊(Anopheles maculipennis)、库态按蚊(Anopheles crucians)、淡色按蚊(Anopheles albimanus)、冈比亚按蚊(Anopheles gambiae)、费氏按蚊(Anopheles freeborni)、白踝按蚊(Anopheles leucosphyrus)、微小按蚊(Anopheles minimus)、四斑按蚊(Anopheles quadrimaculatus)、红头丽蝇(Calliphora vicina)、地中海实蝇(Ceratitis capitata)、蛆症金蝇(Chrysomya bezziana)、美洲金蝇(Chrysomya hominivorax)、稻金蝇(Chrysomya macellaria)、鹿蝇(Chrysops discalis)、黄赭色斑虻(Chrysops silacea)、大西洋斑虻(Chrysops atlanticus)、羊旋皮蝇(Cochliomyia hominivorax)、高粱瘿蚊(Contarinia sorghicola)、盾波蝇(Cordylobia anthropophaga)、毛库蠓(Culicoides furens)、五带淡色库蚊(Culex pipiens)、黑须库蚊(Culex nigripalpus)、致倦库蚊(Culex quinquefasciatus)、媒库蚊(Culex tarsalis)、纯色脉毛蚊(Culiseta inornata)、黑尾脉毛蚊(Culiseta melanura)、瓜实蝇(Dacus cucurbitae)、油橄榄实蝇(Dacus oleae)、芸苔荚瘿蚊(Dasineura brassicae)、葱地种蝇(Delia antique)、麦地种蝇(Delia coarctata)、灰地种蝇(Delia platura)、甘蓝地种蝇(Delia radicum)、人肤蝇(Dermatobia hominis)、黄腹厩蝇(Fannia canicularis)、三点禾蝇(Geomyza Tripunctata)、大马胃蝇(Gasterophilus intestinalis)、刺舌蝇(Glossina morsitans)、须舌蝇(Glossina palpalis)、引舌蝇(Glossina fuscipes)、胶舌蝇(Glossina tachinoides)、骚扰角蝇(Haematobia irritans)、鞍形瘿蚊(Haplodiplosis equestris)、潜蝇属(Hippelates spp.)、种蝇(Hylemyia platura)、纹皮蝇(Hypoderma lineata)、勒蠓(Leptoconops torrens)、美洲斑潜蝇(Liriomyza sativae)、非洲菊斑潜蝇(Liriomyza trifolii)、山羊绿蝇(Lucilia caprina)、铜绿蝇(Lucilia cuprina)、丝光绿蝇(Lucilia sericata)、白杨花蝇(Lycoria pectoralis)、曼蚊(Mansonia titillanus)、黑森麦杆蝇(Mayetiola destructor)、秋家蝇(Musca autumnalis)、家蝇(Musca domestica)、厩腐蝇(Muscina stabulans)、羊鼻蝇(Oestrus ovis)、禾蝇(Opomyza florum)、瑞典麦秆蝇(Oscinella frit)、甜菜潜叶蝇(Pegomya hysocyami)、葱蝇(Phorbia antiqua)、甘蓝蝇(Phorbia brassicae)、麦蝇(Phorbia coarctata)、银足白蛉(Phlebotomus argentipes)、哥伦比亚鳞蚊(Psorophora columbiae)、胡萝卜茎蝇(Psila rosae)、异色鳞蚊(Psorophora discolor)、混合墨蚊(Prosimulium mixtum)、樱桃实蝇(Rhagoletis cerasi)、苹果实蝇(Rhagoletis pomonella)、红尾肉蝇(Sarcophaga haemorrhoidalis)、肉蝇属(Sarcophaga spp.)、带蚋(Simulium vittatum)、厩刺蝇(Stomoxys calcitrans)、牛虻(Tabanus bovinus)、黑虻(Tabanus atratus)、具带马虻(Tabanus lineola)、拟原虻(Tabanus similis)、普通大蚊(Tipula oleracea)及欧洲大蚊(Tipula paludosa);

[0319] 半翅目(Hemiptera),尤其是蚜虫(aphids):驴豆蚜(Acyrthosiphon

onobrychis)、落叶松球蚜(Adelges laricis)、豆瓣蚜(Aphidula nasturtii)、蚕豆蚜(Aphis fabae)、佛氏蚜(Aphis forbesi)、苹果蚜(Aphis pomi)、棉蚜(Aphis gossypii)、醋栗蚜(Aphis grossulariae)、施氏蚜(Aphis schneideri)、绣线菊蚜(Aphis spiraecola)、山茨蚜(Aphis sambuci)、豌豆蚜(Acyrthosiphon pisum)、马铃薯长须蚜(Aulacorthum solani)、蓟短尾蚜(Brachycaudus cardui)、圆尾蚜(Brachycaudus helichrysi)、桃黑短尾蚜(Brachycaudus persicae)、梅蚜(Brachycaudus prunicola)、甘蓝蚜(Brevicoryne brassicae)、角钉毛蚜(Capitophorus horni)、方翅网蝽(Cerosipha gossypii)、草莓毛管蚜(Chaetosiphon fragaefolii)、茶藨隐瘤额蚜(Cryptomyzus ribis)、诺曼尼椎球蚜(Dreyfusia nordmannianae)、云杉椎球蚜(Dreyfusia piceae)、根瘤蚜(Dysaphis radicola)、绿薯蚜(Dysaulacorthum pseudosolani)、苹粉红劣蚜(Dysaphis plantaginea)、梨蚜(Dysaphis pyri)、马铃薯叶蝉(Empoasca fabae)、梅大尾蚜(Hyalopterus pruni)、茶藨苦菜蚜(Hyperomyzus lactucae)、麦长管蚜(Macrosiphum avenae)、大戟长管蚜(Macrosiphum euphorbiae)、蔷薇长管蚜(Macrosiphon rosae)、蚕豆修尾蚜(Megoura viciae)、梨蚜(Melanaphis pyrarius)、蔷薇麦蚜(Metopolophium dirhodum)、桃蚜(Myzodes persicae)、冬葱蚜(Myzus ascalonicus)、樱桃黑瘤额蚜(Myzus cerasi)、变异蚜(Myzus varians)、蒿苣蚜(Nasonovia ribis-nigri)、褐飞虱(Nilaparvata lugens)、囊柄瘿绵蚜(Pemphigus bursarius)、蔗飞虱(Perkinsiella saccharicida)、蛇麻疣额蚜(Phorodon humuli)、苹木虱(Psylla mali)、梨木虱(Psylla piri)、冬葱缢瘤蚜(Rhopalomyzus ascalonicus)、玉米缢管蚜(Rhopalosiphum maidis)、禾谷缢管蚜(Rhopalosiphum padi)、苹果草缢管蚜(Rhopalosiphuminsertum)、马拉圆尾蚜(Sappaphis mala)、马里圆尾蚜(Sappaphis mali)、麦二叉蚜(Schizaphis graminum)、裂鞘叶蚜(Schizoneura lanuginosa)、麦长管蚜(Sitobion avenae)、温室白粉虱(Trialeurodes vaporariorum)、大桔蚜(Toxoptera aurantiiand)及葡萄根瘤蚜(Viteus)。

[0320] 在一较佳实施例中,本发明的式(I)化合物其可用于控制,例如:西花蓟马(Frankliniella occidentalis、western flower thrips)、马铃薯叶蝉(Empoasca fabae、potato leafhopper)、褐飞虱(Nilaparvata lugens、rice brown planthopper)、黑尾叶蝉(Nephotettix virescens、rice green leafhopper)、棉蚜(Aphis gossypii、cotton/melon aphid)、桃蚜(Myzus persicae、green peach aphid)、烟粉虱(Bemisia tabaci、tobacco/sweetpotato whitefly)及银叶粉虱(Bemisia argentifolii、silverleaf whitefly)。

[0321] 在一实施例中,本发明更提供一种组成物,其包含生物有效量的式(I)化合物及至少一选自以下的额外生物活性兼容化合物:杀菌剂、杀虫剂、杀线虫剂、杀螨剂、生物农药、除草剂、植物生长调节剂、抗生素、肥料或营养素。用于该组成物中及与式(I)化合物组合的化合物也称为活性相容化合物。

[0322] 已知报导的杀真菌剂、杀虫剂、杀线虫剂、杀螨剂、生物农药、除草剂、植物生长调节剂、生物刺激素、抗生素及营养素可与至少一种本发明的式(I)化合物组合。例如,在PCT专利公开号WO2016156129及/或PCT专利公开号WO2017153200中公开及报导的杀真菌剂、杀虫剂、杀线虫剂、杀螨剂、生物农药、除草剂、植物生长调节剂、生物刺激素、抗生素、肥料及

营养素可与至少一种本发明的式(I)化合物组合。

[0323] 在某些情况下,与其他无脊椎动物害虫控制化合物或试剂(其具有相似控制谱但作用模式不同)的组合将尤其有利于抗性管理。因此,本发明的组成物可以进一步包含生物有效量的至少一种额外的具有相似控制谱但作用模式不同的无脊椎动物害虫控制的化合物或药剂。使经遗传修饰以表达植物保护化合物(例如蛋白质)的植物或植物所在地与生物有效量的本发明化合物接触,也可以提供更广泛的植物保护且有利于抗性管理。

[0324] 在本发明的一实施例中,式(I)化合物在组成物中的生物有效量为相对于组成物的总重量的0.1%至99%,较佳为相对于组成物的总重量的5%至50%。

[0325] 本发明还提供一种防治昆虫及螨类害虫的方法,所述方法包括:使昆虫及螨类害虫、其栖息地、繁殖地、食物供应处、植物、种子、土壤、区域、材料或昆虫及螨类害虫正在生长或可能生长的环境,或被保护免于害虫侵袭或侵染的材料、植物、种子、土壤、表面或空间与生物有效量的本发明的化合物或其组成物接触。

[0326] 无脊椎动物害虫的控制以及保护农艺、园艺与特色作物、动物与人类健康通过将有效量的一种或多种本发明的化合物施用于害虫的环境(包括农艺的及/或非农艺的作物侵染地)、施用于所要保护的区域,或直接施用于所欲控制的害虫上。因此,本发明更包括控制栖息于叶面及土壤的无脊椎动物及保护农艺的及/或非农艺的作物的方法,该方法包括使无脊椎动物或其环境与生物有效量的一种或多种的本发明的化合物接触,或与包括至少一种此化合物,或包括至少一种此化合物及有效量的至少一种额外的生物活性化合物或试剂的组成物。一种较佳的接触方法是通过喷雾。或者,包含本发明的化合物的颗粒组成物可施用于植物叶子或土壤上。本发明的化合物亦可藉由使植物与以液体制剂的土壤浸液、施用于土壤的颗粒制剂、育苗盒处理或移植物浸渍方式而施用的包含本发明的化合物的组成物接触来经由植物吸收以进行有效传递。其他接触方法包括藉由直接及残余喷雾、空气喷雾、凝胶、种子涂层、微囊化(microencapsulations)、系统吸收、诱饵、耳标、大丸剂(boluses)、喷雾剂、烟熏剂、气溶胶、粉剂及许多其他者施用本发明的化合物或组成物。

[0327] 本发明的化合物可并入由无脊椎有害动物消耗或在诸如陷阱、诱饵台及其类似物的装置中使用的诱饵中。包含0.01%-5%的有效成分、0.05%-10%的保湿剂以及40%-99%的蔬菜粉的颗粒或诱饵,其在极低施用率下、尤其在藉由摄取而非藉由直接接触而致命的活性成分剂量下,可有效控制土壤昆虫。本发明的化合物可以其纯物质应用,但最常见的应用是包含一种或多种化合物与合适的载体、稀释剂及界面活性剂的制剂,并且可能根据预期的最终用途与食品组合。较佳的应用方法包括喷洒化合物的水分散体或精炼油溶液。与喷雾油、喷雾油浓缩物、展布剂、黏附剂、佐剂、其他溶剂及诸如胡椒基丁氧化物(piperonyl butoxide)的增效剂组合通常增强化合物功效。

[0328] 有效控制所需的施用率(亦即“生物上有效量(biologically effective amount)”)应视如待控制的无脊椎动物的种类,有害动物的生命周期、生命阶段、其尺寸、地点、季节、主体作物或动物、摄食行为、交配行为、周围湿度、温度及其类似因素的该因素而定。在正常环境下,每公顷约0.01公斤至2公斤的活性成分的施用率足以控制农艺生态系统中的有害动物,但少至每公顷0.0001公斤可为足够的或多至每公顷8公斤可为需要的。对于非农业应用而言,有效施用率应在约1.0毫克/平方公尺至50毫克/平方公尺的范围内,但少至0.1毫克/平方公尺可为足够的或多至150毫克/平方公尺可为需要的。本案所属技术领域

中具有通常知识者可易于确定所需无脊椎有害动物控制程度所需的生物上有效量。

[0329] 动物害虫(即节肢动物、腹足动物及线虫)、植物、该植物所生长的土壤或水可通过任何已为本案所属技术领域所熟知的应用方式与式(I)化合物、其N-氧化物及盐,或包含式(I)化合物、其N-氧化物及盐的组成物接触。如本文所使用的用语“接触”(contacting)包括直接接触(将化合物/组成物直接施用于动物害虫或植物,通常施用于植物的叶子、茎或根)及间接接触(将化合物/组成物施用于动物害虫或植物的所在地)。

[0330] 本发明的化合物或包含上述化合物的杀虫组成物可通过使植物/作物与本发明的化合物的至少一杀虫有效量接触,用于保护正在生长的植物/作物免于被动物害虫(尤其是昆虫纲、螨科或蛛形纲)攻击或感染。用语“作物”是指正在生长的及已收成的作物二者。

[0331] 因此,本发明涉及一种保护作物免受无脊椎动物害虫攻击或侵染的方法,该方法包含:使该作物与一生物有效量的本发明的化合物或其组成物、异构物、多晶型物、N-氧化物或其盐接触。

[0332] 本发明的化合物本身或以组成物的形式,通过将杀虫有效量的该活性化合物施用于昆虫或植物、植物繁殖材料(例如种子、土壤、表面、材料或被保护免于受到杀虫攻击的空间)。上述施用可在植物、植物繁殖材料(例如种子、土壤、表面、材料或空间)被昆虫侵染之前及之后进行。

[0333] 因此,本发明也涉及一种保护种子免受土壤昆虫侵害及保护幼苗根及芽免受土壤及叶面昆虫侵害的方法,该方法包含:于播种及/或发芽前,使该种子与本发明的化合物或组成物、其N-氧化物或盐接触。

[0334] 更进一步地,本发明涉及一种治疗或保护动物免受寄生虫侵扰或侵染的方法,该方法包含:将本发明的一生物上有效量的化合物或其组成物、异构物、多晶型物、N-氧化物或兽医学上可接受的盐,口服地、局部地或非肠地道施予或施用到该动物。

[0335] 对于用于处理农作物,本发明的化合物的施用率(施用有效剂量)可为在农业或园艺作物中每公顷1克活性成分(gai)至5000克活性成分(gai)的范围内,较佳为每公顷25公克至600公克,更佳为每公顷35公克至300公克。

[0336] 本发明的化合物及组成物尤其适合用于控制各种栽培植物上的大量昆虫,上述栽培植物例如谷物、块根作物、油料作物、蔬菜、香料、观赏植物,例如硬粒小麦的种子及其他小麦、大麦、燕麦、黑麦、玉米(饲料玉米及糖用玉米/甜玉米及普通玉米)、大豆、油料作物、十字花科植物、棉花、向日葵、香蕉、稻米、油菜、芜菁油菜、糖用甜菜、饲料甜菜、茄子、马铃薯、草、草坪、草皮、饲料草、蕃茄、韭菜、番瓜(pumpkin)/南瓜(squash)、甘蓝、卷心莴苣、胡椒、黄瓜、甜瓜、芸苔属(Brassica species)植物、甜瓜、菜豆、豌豆、大蒜、洋葱、胡萝卜、块茎植物诸如马铃薯、糖用甘蔗、烟草、葡萄、矮牵牛、老鹳草(geranium)/天竺葵(pelargoniums)、三色紫罗兰及凤仙花。

[0337] 尤其地,本发明的化合物或组成物可用于保护农作物,例如谷物、玉米、稻米、大豆及其他豆科植物、水果及果树、葡萄、坚果及坚果树、柑橘及柑橘树、任何园艺植物、葫芦科、油料植物、烟草、咖啡、茶叶、可可、糖用甜菜、糖用甘蔗、棉花、马铃薯、蕃茄、洋葱、胡椒及其他蔬菜以及观赏植物。

[0338] 本发明也涉及一种选自式(I)的化合物的制备方法。

[0339] 本发明的化合物通过接触(通过土壤、玻璃、墙壁、蚊帐、地毯、植物部分或动物部

分)及摄取(诱饵或植物部分)都有效。

[0340] 本发明的化合物还可用于对抗非作物的昆虫或螨类害虫,例如蚂蚁、白蚁、黄蜂、苍蝇、蚊子、蟋蟀或蟑螂。为了用于对抗所述非作物的害虫,本发明的化合物较佳地是用于诱饵组成物中。

[0341] 诱饵可为液体、固体或半固体配制品(例如凝胶)。固体诱饵可形成适于个别施用的各种形状及形式,例如颗粒、块状、棒状、盘状。液体诱饵可填充于各种装置例如敞开容器、喷洒装置、液滴源或蒸发源中以确保适当施用。凝胶可基于水性或油性基质,且可在黏性、保水性或老化特征方面针对特定需求调配。

[0342] 用于组成物中的诱饵为有充分吸引力以引诱诸如蚂蚁、白蚁、黄蜂、苍蝇、蚊子、蟋蟀等或蟑螂的昆虫吃诱饵的产品。吸引力可由使用进食刺激剂或性费洛蒙操纵。食物刺激剂选自例如(但不限于)动物及/或植物蛋白质(肉粉、鱼粉或血粉、昆虫部分、蛋黄),选自动物来源及/或植物来源的脂肪及油,或单有机醣、寡有机醣或多有机醣,尤其选自蔗糖、乳糖、果糖、右旋糖、葡萄糖、淀粉、果胶或甚至糖蜜或蜂蜜。水果、作物、植物、动物、昆虫或其特定部分的新鲜或腐烂部分亦可用作进食刺激剂。已知性费洛蒙更具昆虫特异性。特异性费洛蒙描述于文献中且为熟习此项技术者所知。

[0343] 对于于诱饵组成物时,活性成分的典型含量为0.001重量%至15重量%、理想地0.001重量%至5重量%的活性化合物。

[0344] 本发明的化合物的制剂呈气溶胶(例如于喷雾罐中)、油喷雾剂或泵喷雾剂形式高度适于非专业使用者用于控制诸如苍蝇、跳蚤、蜱(tick)、蚊子或蟑螂的害虫。气溶胶制剂较佳由以下组成:活性化合物;溶剂,诸如低碳醇(例如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇)、酮(例如丙酮、甲基乙基酮)、具有约50℃至250℃的沸点范围的石蜡烃(例如煤油)、二甲基甲酰胺、N-甲基吡咯啶酮、二甲亚砜、芳族烃(诸如甲苯、二甲苯)、水;此外,助剂,诸如乳化剂,诸如山梨糖醇单油酸酯、具有3至7莫耳的环氧乙烷的油基乙氧基化物、脂肪醇乙氧基化物、香料油(诸如香精油)、中碳脂肪酸与低碳醇形成的酯、芳族羰基化合物;适当时,稳定剂(诸如苯甲酸钠)、两性界面活性剂、低碳环氧化物、原甲酸三乙酯;及需要时,推进剂,诸如丙烷、丁烷、氮气、压缩空气、二甲醚、二氧化碳、氧化亚氮或该气体的混合物。

[0345] 油喷雾剂制剂与气溶胶制剂不同之处在于不使用推进剂。用于喷雾剂组成物时,活性成分的含量为0.001重量%至80重量%、较佳地0.01重量%至50重量%、最佳地0.01重量%至15重量%的活性化合物。

[0346] 本发明的化合物及其各自的组成物也可用于蚊香及熏蒸盘管(fumigating coils)、烟筒、蒸发器板或长期蒸发器以及防蛾纸、防蛾垫或其他与热无关的蒸发器系统中。

[0347] 用式(I)化合物及其各自的组成物控制由昆虫传播的传染病(例如疟疾、登革热(dengue)及黄热病、淋巴丝虫病及利什曼病(leishmaniasis))的方法亦包含处理棚屋及房屋的表面,空气喷洒及浸渍窗帘、帐篷、衣物用品、蚊帐、捕舌蝇器或其类似物。施加于纤维、织品、针织品、非编织品、编网材料或箔及防水布的杀昆虫性组成物较佳包含包括杀昆虫剂、视情况任选的拒避剂及至少一种黏合剂的混合物。合适的拒避剂为例如N,N-二乙基-间甲苯酰胺(N,N-Diethyl-meta-toluamide)(DEET)、N,N-二乙基苯基乙酰胺(N,N-diethylphenylacetamide)(DEPA)、1-(3-环己-1-基-羰基)-2-甲基哌嗪(1-(3-

cyclohexan-1-yl-carbonyl)-2-methylpiperine)、(2-羟基甲基环己基)乙酸内酯((2hydroxymethylcyclohexyl)acetic acid lactone)、2-乙基-1,3-己二醇(2-ethyl-1,3-hexandiol)、避虫酮(indalone)、甲基新癸酰胺(Methylneodecanamide)(MNDA)、非用于昆虫控制的拟除虫菊酯(pyrethroid)(诸如{(+/-)-3-烯丙基-2-甲基-4-侧氧基环戊-2-(+)-烯基-(+)-反-菊酸酯({(+/-)-3-allyl-2-methyl4-oxocyclopent-2-(+)-enyl-(+)-trans-chrysantemate)(Esbiothrin))、来源于植物提取物或与其相同的拒避剂(如柠檬烯、丁香酚、(+)-优卡醇(1)((+)-Eucamalol(1))、(-)-1-表优卡醇((-)-1-epi-eucamalol)),或来源于植物的粗植物提取物的拒避剂(如柠檬胺(Eucalyptus maculata)、单叶蔓荆(Vitex rotundifolia)、玫瑰草(Cymbopogan martinii)、柠檬草(Cymbopogan citratus)、香茅(Cymopogan nartdus))。合适的黏合剂是选自例如以下的聚合物及共聚物:脂族酸类的乙烯酯(诸如乙酸乙烯酯及维吾尔酸乙烯酯(vinyl versatate))、醇类的丙烯酸酯及甲基丙烯酸酯(诸如丙烯酸丁脂、2-乙基己酯及丙烯酸甲酯)、单烯系及二烯系不饱和烃(诸如苯乙烯)及脂族二烯(诸如丁二烯)。

[0348] 浸渍窗帘及蚊帐一般藉由将织物材料浸入乳液或分散液中或将乳液或分散液喷洒于帐上来进行。

[0349] 本发明的化合物及混合物及其组成物可用于保护木质材料,诸如树木、木栅栏、枕木、框架、艺术品等及建筑物,且亦用于保护构筑材料、家具、皮革、纤维、乙烯基制品、电线及电缆等免遭蚂蚁及/或白蚁,以及用于控制蚂蚁及白蚁对作物或人类造成伤害(例如当有害生物侵入房屋及公共设施时)。本发明的化合物不仅应用于周围土壤表面或地板下土壤,以保护木质材料,还可应用于木材制品(例如地板下混凝土的表面、壁龛柱、横梁、胶合板、家具等),木制品(例如刨花板、半板等)及乙烯基制品(例如涂层电线、乙烯基片材、绝热材料(例如泡沫苯乙烯)等)。

[0350] 种子处理

[0351] 本发明进一步涉及一种种子,该种子包含本发明的化合物,尤其是该种子于处理前的种子量为以重量计约0.0001%至约1%。

[0352] 本发明的化合物尤其可用于保护种子免受土壤害虫的侵害及保护所得植物的根及芽免受土壤害虫及叶面昆虫的侵害。较佳的是保护所得植物的根及芽。更佳的是保护所得植物的芽免受刺吸式昆虫的侵害,其中最佳的是保护免受蚜虫的侵害。

[0353] 因此,本发明包括一种保护种子免受昆虫(尤其是土壤昆虫)的侵害及保护该种子的幼苗根及芽免受昆虫(尤其是土壤及叶面昆虫)的侵害的方法,该方法包括:在播种该种子之前及/或该种子预发芽之后,使该种子与本发明的化合物接触。尤其佳的是一种方法,其是保护植物的根及芽;更佳的是一种方法,其是保护植物的芽免受刺吸式及吸吮昆虫侵害;最佳的是一种方法,其是保护植物的芽免受蚜虫侵害。

[0354] 用语种子涵盖所有类别的种子及植物繁殖体,包括但不限于种子块、吸根、球茎、鳞茎、果实、块茎、谷粒、插条、切枝及其类似物,且在一较佳实施例中意谓真正的种子。

[0355] 用语种子处理包含此项技术中已知的所有适合的种子处理技术,诸如拌种、种子包衣、种子撒粉、种子浸泡及种子丸化。

[0356] 本发明还包括用活性化合物包衣或含有活性化合物的种子。此些种子可使用含有本发明的化合物的种子包衣组成物进行包衣。例如,种子包衣组成物报导于欧洲专利号

EP3165092、欧洲专利号EP3158864、PCT专利公开号WO2016198644、PCT专利公开号WO2016039623、PCT专利公开号WO2015192923、加拿大专利号CA2940002、美国专利公开号US2006150489、美国专利公开号US2004237395、PCT专利公开号WO2011028115、欧洲专利号EP2229808、PCT专利公开号WO2007067042、欧洲专利号EP1795071、欧洲专利号EP1273219、PCT专利公开号WO200178507、欧洲专利号EP1247436、荷兰专利号NL1012918及加拿大专利号CA2083415。

[0357] 用语“包覆有及/或含有”(coated with and/or containing)一般表示活性成分在施用时大部分在繁殖产品的表面上,尽管成分的更多或更少部分可渗透至繁殖产品中,视施用方法而定。当(再)种植该繁殖产品时,其可吸收活性成分。

[0358] 适合的种子为例如谷物、块根作物、油料作物、蔬菜、香料、观赏植物的,例如硬粒小麦的种子及其他小麦、大麦、燕麦、黑麦、玉米(饲料玉米及糖用玉米/甜玉米及普通玉米)、大豆、油料作物、十字花科植物、棉花、向日葵、香蕉、稻米、油菜、芜菁油菜、糖用甜菜、饲料甜菜、茄子、马铃薯、草、草坪、草皮、饲料草、蕃茄、韭菜、番瓜/南瓜、甘蓝、卷心莴苣、胡椒、黄瓜、甜瓜、芸苔属、甜瓜、菜豆、豌豆、大蒜、洋葱、胡萝卜、块茎植物诸如马铃薯、糖用甘蔗、烟草、葡萄、矮牵牛、老鹳草/天竺葵、三色紫罗兰及凤仙花的种子。

[0359] 另外,本发明的化合物亦可用于处理来自植物的种子,该植物因配种(包含基因工程)而耐受除草剂或杀真菌剂或杀昆虫剂的作用。

[0360] 例如,本发明的化合物可用于处理来自植物的种子,其对选自由磺酰脲类(sulfonylureas)、咪唑啉酮类(imidazolinones)、草铵膦(glufosinate-ammonium)或草甘膦-异丙铵(glyphosate-isopropylammonium)以及类似活性物质所组成的群组的除草剂具有抗性(参见例如,欧洲专利号EP242236、欧洲专利号EP242246)(PCT专利公开号WO92/00377)(美国专利号EP257993、美国专利号US5013659),或在基因转殖作物植物(例如棉花)中,其具有产生苏云金芽孢杆菌毒素(Bt毒素)的能力,并使该植物对某些害虫具有抗性(欧洲专利号EP142924、欧洲专利号EP193259)。

[0361] 此外,本发明的化合物可用于处理来自植物的种子,其与现有植物相比具有修饰的特性,其可通过例如传统育种方法及/或产生突变体、或藉由重组程序产生。例如,许多案例已描述以修饰植物中合成的淀粉为目的(例如PCT专利公开号WO92/11376、PCT专利公开号WO92/14827、PCT专利公开号WO91/19806)或以具有修饰的脂肪的基因转殖作物植物为目的(PCT专利公开号WO91/13972)的作物植物的重组修饰。

[0362] 本发明化合物的种子处理施用是在植物播种前及植物出苗前通过喷洒或撒种进行。

[0363] 特别适用于种子处理的组成物是例如:

[0364] A.水溶性浓缩物(SL,LS)

[0365] B.乳液(EW,EO,ES)

[0366] C.悬浮液(SC,OD,FS)

[0367] D.水分散性粒剂及水溶性粒剂(WG,SG)

[0368] E.水分散性散剂及水溶性散剂(WP,SP,WS)

[0369] F.凝胶制剂(GF)

[0370] G.可粉化散剂(DP,DS)

[0371] 常规的种子处理制剂包括例如可流动浓缩物(FS)、溶液(LS)、用于干燥处理的散剂(DS)、用于浆液处理的水可分散性散剂(WS)、水溶性散剂(SS)及乳液(ES及EC)及凝胶调配物(GF)。该制剂可施加于经稀释或未经稀释的种子。可在播种之前直接施加于种子,或在种子发芽后施加于种子。

[0372] 在一实施例中,使用FS制剂进行种子处理。通常,FS制剂可包含1-800g/l的活性成分、1-200g/l界面活性剂、0至200g/l防冻剂、0至400g/l的黏合剂、0至200g/l的颜料及多至1公升的溶剂,较佳为水。

[0373] 用于种子处理的本发明的化合物的其他较佳FS制剂包含0.1至80重量%(1至800g/l)的活性成分、0.1至20重量%(1至200g/l)的至少一种表面活性剂(例如0.05至5重量%的湿润剂)及0.5至15重量%的分散剂、多至20重量%(例如5至20重量%)的防冻剂、0至15重量%(例如1至15重量%)的颜料及/或染料、0至40重量%(例如1至40重量%)的黏合剂(黏附剂/黏着剂)、选择性地多至5重量%(例如0.1至5重量%)的增稠剂,选择性地0.1至2重量%的消泡剂及选择性地防腐剂(例如杀生物剂、抗氧化剂等,例如其用量为0.01至1重量%)及多至100重量%的填料/载体。

[0374] 种子处理制剂可另外包含黏合剂及选择性的着色剂。

[0375] 可添加黏合剂以提高处理后活性材料对种子的附着力。合适的黏合剂是来自环氧烷(例如环氧乙烷或环氧丙烷)的均聚物及共聚物、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇、聚乙烯吡咯烷酮及其共聚物、乙烯-乙酸乙烯酯共聚物、丙烯酸的均聚物及共聚物、聚乙烯胺、聚乙烯酰胺及聚乙烯嘧啶、多醣(例如纤维素、纤维素及淀粉)、聚烯烃的均聚物及共聚物(例如烯烃/马来酸酐共聚物、聚胺酯、聚酯、聚苯乙烯的均聚物及共聚物)。

[0376] 可选择地,着色剂也可包含在制剂中。适用于种子处理制剂的着色剂或染料为罗丹明B(Rhodamin B)、C.I.颜料红112、C.I.溶剂红1、颜料蓝15:4、颜料蓝15:3、颜料蓝15:2、颜料蓝15:1、颜料蓝80、颜料黄1、颜料黄13、颜料红1 12、颜料红48:2、颜料红48:1、颜料红57:1、颜料红53:1、颜料橙43、颜料橙34、颜料橙5、颜料绿36、颜料绿7、颜料白6、颜料棕25、碱性紫10、碱性紫49、酸性红51、酸性红52、酸性红14、酸性蓝9、酸性黄23、碱性红10、碱性红108。

[0377] 胶凝剂的一个实例是角叉菜胶(Satiagel®)。

[0378] 在种子处理中,本发明化合物的施用率一般为每100公斤种子0.1公克至10公斤,较佳地每100公斤种子1公克至5公斤,更佳地每100公斤种子1公克至1公斤,尤其是每100公斤种子1公克至200公克。因此,本发明还提供包含如本文所定义的式(I)化合物或式(I)化合物的农业上有用的盐的种子。式(I)化合物或其农业上有用的盐的量通常为每100公斤种子0.1公克至10公斤,较佳地每100公斤种子1公克至5公斤,尤其是每100公斤种子1公克至1公斤。对于特定农作物来说,例如莴苣,其施用率可以更高。

[0379] 动物健康

[0380] 本发明还提供包含一种农业及/或兽医用组成物,包括本发明的至少一种化合物。

[0381] 本发明还涉及本发明的化合物、N-氧化物或兽医学上可接受的盐、或其组成物的用途,其用于制备治疗或保护动物免受昆虫及螨虫或寄生虫侵扰或感染的药物。

[0382] 式(I)化合物、其N-氧化物及/或其兽医学上可接受的盐也尤其适用于防治动物体内及体表的寄生虫。

[0383] 因此,本发明的一个目的是提供控制动物体内及身上的寄生虫的新方法。本发明的另一个目的是提供更安全的动物用杀虫剂。本发明的另一个目的是提供可以比现有农药更低剂量使用的动物用农药。本发明的另一个目的是提供动物用杀虫剂,它能对寄生虫进行持久的控制。

[0384] 本发明还涉及包含杀寄生虫的有效量的至少一式(I)化合物、N-氧化物或其兽医学上可接受的用盐及可接受的载体的组成物,其用于防治动物体内及体表的寄生虫。

[0385] 本发明还提供了一种用于治疗、控制、预防及保护动物免受寄生虫侵扰及感染的方法,该方法包括对动物口服、局部或肠胃外施予或施用杀寄生虫的有效量的本发明的化合物或包含该化合物的组成物。

[0386] 本发明还提供了用于治疗、控制、预防或保护动物免受寄生虫侵染或感染的组成物的制备方法,该组成物包含杀寄生虫的有效量的本发明的化合物或包含该化合物的组成物。

[0387] 化合物对抗农业害虫的活性并不表明其适于控制动物体内及体表的内寄生虫及外寄生虫,此需要例如低的非催吐性剂量(在经口施加的状况下)、与动物的代谢兼容性、低毒性及安全操作性。

[0388] 已惊人地发现,本发明的化合物适于对抗动物体内及体表之内寄生虫及外寄生虫。

[0389] 本发明的化合物及包含该化合物的组成物较佳用于控制及预防对包括温血动物(包括人类)及鱼的动物的侵染及感染。其例如适于控制及预防对以下的侵染及感染:哺乳动物,诸如牛、绵羊、猪(swine)、骆驼、鹿、马、猪(pig)、家禽、兔、山羊、犬及猫、水牛、驴、黄鹿及驯鹿;以及毛皮动物,诸如貂、栗鼠及浣熊;鸟类,诸如鸡、鹅、火鸡及鸭;及鱼类,诸如淡水鱼及咸水鱼,诸如鳟鱼、鲤鱼及鳗鱼。

[0390] 本发明的化合物及包含该化合物的组成物较佳用于控制及预防对诸如犬或猫的家养动物的侵染及感染。

[0391] 对温血动物及鱼的侵染包括,但不限于虱、咬虱、壁虱、鼻虫、蜱、咬蝇、蠓蝇、苍蝇、蝇蛆病蝇幼虫、恙虫、蚋、蚊子及跳蚤。

[0392] 本发明的化合物及包含该化合物的组成物适于对外寄生虫及/或内寄生虫进行全身性及/或非全身性控制。其具有对抗发育的全部或部分阶段的活性。

[0393] 本发明的化合物及包含该化合物的组成物尤其适用于防治外寄生虫。

[0394] 本发明的化合物尤其适用于对抗以下目及种的寄生虫,分别为:蚤类(蚤目(Siphonaptera)),例如猫栉头蚤(Ctenocephalides felis)、狗栉头蚤(Ctenocephalides canis)、印度鼠蚤(Xenopsylla cheopis)、人蚤(Pulex irritans)、潜蚤(Tunga penetrans)及条纹鼠蚤(Nosopsyllus fasciatus),蟑螂类(蜚蠊目(Blattaria-Blattodea)),例如德国小蠊(Blattella germanica)、亚洲蟑螂(Blattella asahinae)、美洲大蠊(Periplaneta americana)、日本大蠊(Periplaneta japonica)、棕色蜚蠊(Periplaneta brunnea)、黑胸大蠊(Peroplaneta fuligginosa)、澳洲蜚蠊(Periplaneta australasiae)及东方蜚蠊(Blatta orientalis),蝇类、蚊类(双翅目),例如埃及伊蚊(Aedes aegypti)、白线伊蚊(Aedes albopictus)、刺扰伊蚊(Aedes vexans)、墨西哥橘实蝇(Anastrepha ludens)、五斑按蚊(Anopheles maculipennis)、十字按蚊(Anopheles

crucians)、白足按蚊(Anopheles albimanus)、疟蚊(Anopheles gambiae)、西部疟蚊(Anopheles freeborni)、白踝疟蚊(Anopheles leucosphyrus)、微小疟蚊(Anopheles minimus)、四纹疟蚊(Anopheles quadrimaculatus)、红头丽蝇(Calliphora vicina)、蛆症金蝇(Chrysomya bezziana)、美洲金蝇(Chrysomya hominivorax)、稻金蝇(Chrysomya macellaria)、鹿蝇(Chrysops discalis)、鹿斑虻(Chrysops silacea)、大西洋斑虻(Chrysops atlanticus)、螺旋蝇(Cochliomyia hominivorax)、盾波蝇(Cordylobia anthropophaga)、氟仑库蠓(Culicoides furens)、五带淡色库蚊(Culex pipens)、斑蚊(Culex nigripalpus)、热带家蚊(Culex quinquefasciatus)、媒斑蚊(Culex tarsalis)、白斑绒蚊(Culiseta inornata)、黑尾绒蚊(Culiseta melanura)、马蝇(Dermatobia hominis)、黄腹厩蝇(Fannia canicularis)、大马胃蝇(Gasterophilus intestinalis)、刺舌蝇(Glossina morsitans)、触舌蝇(Glossina palpalis)、毒舌蝇(Glossina fuscipes)、须舌蝇(Glossina tachinoides)、骚扰角蝇(Haematobia irritans)、马鞍形糠蚊(Haplodiplosis equestris)、潜蝇属(Hippelates spp.)、纹皮蝇(Hypoderma lineata)、山谷黑细蠓(Leptoconops torrens)、山羊绿蝇(Lucilia caprina)、铜绿蝇(Lucilia cuprina)、丝光绿蝇(Lucilia sericata)、黑胸蕈蚊(Lycoria pectoralis)、孟松蚊属(Mansonia spp.)、家蝇(Musca domestica)、厩腐蝇(Muscina stabulans)、羊鼻蝇(Oestrus ovis)、银足白蛉(Phlebotomus argentipes)、黑稻田鳞蚊(Psorophora columbiae)、褪色鳞蚊(Psorophora discolor)、混合蚋(Prosimulium mixtum)、红尾肉蝇(Sarcophaga haemorrhoidalis)、肉蝇属(Sarcophaga sp.)、吊兰蚋(Simulium vittatum)、刺蝇(Stomoxys calcitrans)、牛虻(Tabanus bovinus)、黑马虻(Tabanus atratus)、细条马虻(Tabanus lineola)及斑马虻(Tabanus similis),虱类(虱目(Phthiraptera)),例如人头虱(Pediculus humanus capitis)、人体虱(Pediculus humanus corporis)、耻阴虱(Pthirus pubis)、牛虱(Haematopinus eurysternus)、猪虱(Haematopinus suis)、牛颚虱(Linognathus vituli)、牛鸟虱(Bovicola bovis)、鸡虱(Menopon gallinae)、大鸡虱(Menacanthus stramineus)及小短鼻牛虱(Solenopotes capillatus),壁虱类及寄生螨类(寄螨目(Parasitiformes)):壁虱类(蜱亚目(Ixodida)),例如肩胛真壁虱(Ixodes scapularis)、全环硬蜱(Ixodes holocyclus)、太平洋硬蜱(Ixodes pacificus)、棕色犬壁虱(Rhiphicephalus sanguineus)、安氏落矶山壁虱(Dermacentor andersoni)、狗矩头壁虱(Dermacentor variabilis)、美洲花蜱(Amblyomma americanum)、墨西哥湾耳扁虱(Ambryommama culatum)、啮齿壁虱(Ornithodorus hermsi)、回归热壁虱(Ornithodorus turicata)及寄生螨类(中气门亚目(Mesostigmata)),例如柏氏禽刺螨(Ornithonyssus bacoti)及鸡皮刺螨(Dermanyssus gallinae),辐螨亚目(Actinedida)(前气门亚目(Prostigmata))及粉螨亚目(Acaridida)(无气门亚目(Astigmata)),例如蜂盾螨属(Acarapis spp.)、姬螯螨属(Cheyletiella spp.)、鸟扇羽螨属(Ornithocheyletia spp.)、鼠螨属(Myobia spp.)、羊痒螨属(Psorergates spp.)、蠕形螨属(Demodex spp.)、恙螨属(Trombicula spp.)、牦螨属(Listrophorus spp.)、毛囊虫属(Acarus spp.)、食酪螨属(Tyrophagus spp.)、嗜木螨属(Caloglyphus spp.)、粉螨属(Hypodectes spp.)、翼羽螨属(Pterolichus spp.)、痒螨属(Psoroptes spp.)、疥癣属(Chorioptes spp.)、耳疥癣属(Otodectes spp.)、疥螨属

(Sarcoptes spp.)、耳螨属(Notoedres spp.)、疥癣虫属(Knemidocoptes spp.)、气囊螨属(Cytodites spp.)及皮膜螨属(Laminosioptes spp.),椿象类(半翅目(Heteropterida)):温带臭虫(Cimex lectularius)、热带臭虫(Cimex hemipterus)、老年食虫椿象(Reduvius senilis)、锥鼻虫属(Triatoma spp.)、红腹猎蝽亚属(Rhodnius ssp.)、锥蝽亚种(Panstrongylus ssp.)及轮形虫(Arilus critatus),虱目(Anoplurida),例如血虱属(Haematopinus spp.)、长颚虱属(Linognathus spp.)、虱虱属(Pediculus spp.)、阴虱属(Phtirus spp.)及管虱属(Solenopotes spp.),毛虱目(Mallophagida)(粗颈豆象亚目(Arnblycerina)及肌虱亚目(Ischnocerina)),例如毛羽虱属(Trimenopon spp.)、鸡虱属(Menopon spp.)、鸭虱属(Trinoton spp.)、牛虱属(Bovicola spp.)、咬虱属(Werneckiella spp.)、绵羊虱属(Lepikentron spp.)、啮毛虱属(Trichodectes spp.)及猫羽虱属(Felicola spp.)。

[0395] 蛔虫线虫纲(Roundworms Nematoda):

[0396] 蛔虫(Wipeworm)及旋毛虫类(Trichinosis)(毛管目(Trichosyringida)),例如旋毛虫科(Trichinellidae)(旋毛虫属(Trichinella spp.))、(鞭虫科(Trichuridae))鞭虫属(Trichuris spp.)、毛细线虫属(Capillaria spp.),杆形目(Rhabditida),例如杆丝虫属(Rhabditis spp.)、拟圆虫属(Strongyloides spp.)、粪类圆线虫属(Helicephalobus spp.),圆虫科(Strongylida),例如圆虫属(Strongylus spp.)、钩虫属(Ancylostoma spp.)、美洲钩虫(Necator americanus)、仰口属(Bunostomum spp.)(钩虫(Hookworm))、毛样线虫属(Trichostrongylus spp.)、捻转胃虫(Haemonchus contortus.)、牛胃丝虫属(Ostertagia spp.)、库柏毛样线虫属(Cooperia spp.)、细颈属(Nematodirus spp.)、网尾线虫属(Dictyocaulus spp.)、杯口线虫属(Cyathostoma spp.)、结节线虫属(Oesophagostomum spp.)、肾虫(Stephanurus dentatus)、盘头线虫属(Ollulanus spp.)、夏柏特属(Chabertia spp.)、肾虫(Stephanurus dentatus)、气管开嘴虫(Syngamus trachea)、钩虫属(Ancylostoma spp.)、弯口属(Uncinaria spp.)、球首属(Globocephalus spp.)、板口线虫属(Necator spp.)、猪肺虫属(Metastrongylus spp.)、毛细苗勒氏肺虫(Muellerius capillaris)、原圆线虫属(Protostrongylus spp.)、住血线虫属(Angiostrongylus spp.)、拟马鹿圆属(Parelaphostrongylus spp.)、猫肺虫(Aleurostrongylus abstrusus)及肾线虫(Dioctophyma renale),肠胃蛔虫类(蛔目(Ascaridida)),例如人蛔虫(Ascaris lumbricoides)、猪蛔虫(Ascaris suum)、鸡蛔虫(Ascaridia galli)、马蛔虫(Parascaris equorum)、蛲虫(Enterobius vermicularis)(丝线虫(Threadworm))、犬蛔虫(Toxocara canis)、狮弓蛔虫(Toxascaris leonine)、斯氏尖尾线虫属(Skrjabinema spp.)及马蛲虫(Oxyuris equi),无唇线虫目(Camallanida),例如麦地纳龙线虫(Dracunculus medinensis)(几内亚虫(Guinea worm)),旋尾目(Spirurida),例如眼虫属(Thelazia spp.)、吴策线虫属(Wuchereria spp.)、布鲁格丝虫属(Brugia spp.)、蟠尾丝虫属(Onchocerca spp.)、心丝虫属(Dirofilaria spp.)、双瓣丝虫属(Dipetalonema spp.)、鬃丝虫属(Setaria spp.)、丝绒虫属(Elaeophora spp.)、血色食道虫(Spirocerca lupi)及马胃虫属(Habronema spp.),钩头虫类(棘头虫目(Acanthocephala)),例如棘头虫属(Acanthocephalus spp.)、猪枣头虫(Macracanthorhynchus hirudinaceus)及犬钩头虫属(Oncicola spp.),涡虫类(扁虫

(Plathelminthes)):吸虫类(吸虫纲(Trematoda)),例如肝吸虫属(Faciola spp.)、大吸虫(Fascioloides magna)、并殖吸虫属(Paragonimus spp.)、双腔吸虫属(Dicrocoelium spp.)、孛斯基姜片虫(Fasciolopsis buski)、中华肝吸虫(Clonorchis sinensis)、住血吸虫属(Schistosoma spp.)、毛血吸虫属(Trichobilharzia spp.)、有翼翼形吸虫(Alaria alata)、并殖吸虫属(Paragonimus spp.)及微胞虫属(Nanocyetes spp.),单殖吸虫(Cercomeromorpha),尤其是条虫类(Cestoda、Tapeworms),例如裂头条虫属(Diphyllobothrium spp.)、条虫种(Tenia spp.)、胞虫属(Echinococcus spp.)、大条虫(Dipylidium caninum)、多头条虫属(Multiceps spp.)、包膜虫属(Hymenolepis spp.)、中殖孔绦虫属(Mesocestoides spp.)、蝙蝠皮绦虫属(Vampirolepis spp.)、莫尼茨属(Moniezia spp.)、裸头绦虫属(Anoplocephala spp.)、迭宫绦虫属(Sirometra spp.)、裸头绦虫属(Anoplocephala spp.)及包膜虫属(Hymenolepis spp.)。

[0397] 式(I)化合物及包含该化合物的组成物尤其适用于控制双翅目(Diptera)、蚤目(Siphonaptera)及蜱亚目(Ixodida)的害虫。

[0398] 此外,式(I)化合物及包含其的组成物用于防治蚊类的用途是本发明的一实施例。

[0399] 本发明的化合物及包含其的组成物用于防治蝇类的用途是本发明的另一实施例。

[0400] 此外,本发明的化合物及包含其的组成物用于防治蚤类的用途是本发明的又一实施例。

[0401] 本发明的化合物及包含其的组成物用于防治蜱类的用途是本发明的又一实施例。

[0402] 本发明的化合物亦尤其适用于对抗内寄生虫(蛔虫线虫纲(roundworms nematoda)、钩头虫类(thorny headed worms)及涡虫类(planarians))。

[0403] 投药是可预防性地及治疗性地进行。

[0404] 本发明的化合物的投药是直接进行或呈合适配制品形式、经口、局部地/经皮地或非经肠地进行。

[0405] 对于经口地向温血动物投予,本发明的化合物可调配成动物饲料、动物饲料预混物、动物饲料浓缩物、药丸、溶液、糊剂、悬浮液、灌服剂、凝胶、锭剂、丸剂及胶囊。另外,本发明的化合物可于动物的饮用水中投予动物。对于经口投药,所选剂型应向动物提供每天每公斤动物体重0.01mg至100mg的本发明的化合物,较佳地每天每公斤动物体重0.5mg至100mg的本发明的化合物。

[0406] 可替代地,本发明的化合物可非经肠地向动物投予,例如经瘤胃内、肌肉内、静脉内或皮下注射投予。本发明的化合物可分散或溶解于生理学上可接受的载剂中以用于皮下注射。可替代地,本发明的化合物可调配成植入物以用于皮下投药。另外,本发明的化合物可经皮地向动物投予。对于非经肠投药,所选剂型应向动物提供每天每公斤动物体重0.01mg至100mg的本发明的化合物。

[0407] 本发明的化合物亦可呈浸液、粉剂、散剂、套环、圆片、喷雾剂、洗发精、点滴及倾倒型制剂的形式及呈软膏或水包油乳液或油包水乳液形式表面施加于动物。对于表面施加,浸液及喷雾剂通常含有0.5ppm至5000ppm且较佳地1ppm至3000ppm的本发明的化合物。另外,本发明的化合物可调配成用于动物、尤其是诸如牛及绵羊的四足动物的耳标。

[0408] 合适的配制品为:溶液,诸如口服溶液、稀释后经口投药的浓缩物、用于皮肤上或体腔内的溶液、倾倒型制剂、凝胶;用于经口或经皮投药的乳液及悬浮液;半固体配制品;其

中活性化合物加工于软膏基质中或水包油乳液或油包水乳液基质中的制剂;固体配制品,诸如散剂、预混物或浓缩物、粒剂、小丸剂、锭剂、大丸剂、胶囊;气溶胶及吸入剂,以及含活性化合物的成形物品。

[0409] 适于注射的组成物藉由将活性成分溶解于合适溶剂中且选择性地添加诸如酸、碱、缓冲盐、防腐剂及增溶剂的其他成分制备。

[0410] 溶液被过滤并无菌填充。

[0411] 合适的溶剂为生理上可耐受的溶剂,诸如水;烷醇,诸如乙醇、丁醇、苯甲醇、甘油、丙二醇、聚乙二醇;N-甲基-吡咯啶酮;2-吡咯啶酮及其混合物。

[0412] 活性化合物可选择性地溶解于适于注射的生理上可耐受的植物油或合成油中。

[0413] 合适的增溶剂为促进活性化合物溶解于主溶剂中或防止其沉淀的溶剂。实例为聚乙烯吡咯啶酮、聚乙烯醇、聚氧乙基化蓖麻油(polyoxyethylated castor oil)及聚氧乙基化脱水山梨糖醇酯(polyoxyethylated sorbitan ester)。

[0414] 合适的防腐剂为苯甲醇、三氯丁醇、对羟苯甲酸酯及正丁醇。

[0415] 口服溶液是直接投予。浓缩物是在预先稀释至使用浓度后经口地投予。口服溶液及浓缩物根据现有技术及如上文中关于注射溶液的描述来制备,无菌程序并非必需的。

[0416] 用于皮肤上的溶液是滴淋、展布、擦拭、喷撒或喷洒于其上。

[0417] 用于皮肤上的溶液根据现有技术且根据上文关于注射溶液的描述来制备,无菌程序并非必需的。

[0418] 其他合适的溶剂为聚丙二醇;苯乙醇;苯氧基乙醇;酯,诸如乙酸乙酯或乙酸丁酯、苯甲酸苯甲酯;醚,诸如烷二醇烷基醚(例如二丙二醇单甲醚);酮,诸如丙酮、甲基乙基酮;芳族烃;植物油及合成油;二甲基甲酰胺;二甲基乙酰胺;二乙二醇单乙醚(transcutol);甘油醇缩丙酮(solketal);碳酸丙二酯及其混合物。

[0419] 在制备过程中添加增稠剂会是有利的。适合的增稠剂是无机增稠剂(例如膨润土、胶体硅酸、单硬脂酸铝)、有机增稠剂(例如纤维素衍生物、聚乙烯醇及其共聚物)、丙烯酸酯以及甲基丙烯酸酯。

[0420] 凝胶是施加于或展布于皮肤上或引入体腔中。凝胶藉由用足够增稠剂处理如在注射溶液的状况下所述制备的溶液来制备,该增稠剂由具有类似软膏稠度的透明物质所形成。所使用的增稠剂为上文所列的增稠剂。

[0421] 倾倒型(pour-on)制剂是倾倒或喷洒于皮肤的限定区域上。活性化合物渗透皮肤且在全身起作用。倾倒型制剂藉由于合适的皮肤兼容性溶剂或溶剂混合物中将活性化合物溶解、悬浮或乳化而制备。适当时,其他助剂(诸如着色剂、生物吸收促进物质、抗氧化剂、光稳定剂、黏着剂)被添加。

[0422] 合适的溶剂为:水;烷醇;二醇;聚乙二醇;聚丙二醇;甘油;芳族醇,诸如苯甲醇、苯乙醇、苯氧基乙醇;酯,诸如乙酸乙酯、乙酸丁酯、苯甲酸苯甲酯;醚,诸如烷二醇烷基醚(诸如二丙二醇单甲醚、二乙二醇单丁醚);酮,诸如丙酮、甲基乙基酮;环状碳酸酯,诸如碳酸丙二酯、碳酸乙二酯;芳族及/或脂族烃;植物油或合成油;DMF;二甲基乙酰胺;N-烷基吡咯啶酮,诸如甲基吡咯啶酮、N-丁基吡咯啶酮或N-辛基吡咯啶酮;N-甲基吡咯烷酮;2-吡咯啶酮;2,2-二甲基-4-氧基-亚甲基-1,3-二氧戊环(2,2-dimethyl-4-oxy-methylene-1,3-dioxolane)或甘油缩甲醛。

[0423] 合适的着色剂为允许用于动物且可溶解或悬浮的所有着色剂。

[0424] 合适的吸收促进物质为:二甲基亚砜;展布油剂,诸如十四烷酸异丙酯、二丙二醇壬酸酯、聚硅氧油及其与聚醚的共聚物、脂肪酸酯、甘油三酯、脂肪醇。

[0425] 合适的抗氧化剂为亚硫酸盐或焦亚硫酸盐(诸如焦亚硫酸钾)、抗坏血酸、丁基羟基甲苯(butylhydroxytoluene)、丁基羟基苯甲醚(butylhydroxyanisole)、生育醇(tocopherol)。

[0426] 合适的光稳定剂为例如2-苯基苯并咪唑-5-磺酸(novantisolic acid)。合适的黏着剂为例如纤维素衍生物、淀粉衍生物、聚丙烯酸酯、天然聚合物,诸如海藻酸盐、明胶。乳液可经口、经皮或注射投予。乳液为油包水型或为水包油型。

[0427] 其藉由将活性化合物溶解于疏水相中或溶解于亲水相中且藉助于合适乳化剂及适当时其他助剂(诸如着色剂、吸收促进物质、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂、黏度增强物质)使其与其他相溶剂均质化而制备。

[0428] 合适的疏水相(油)为:

[0429] 液态石蜡;聚硅氧油;天然植物油,诸如芝麻油、杏仁油、蓖麻油;合成甘油三酯,诸如与链长Cs-Ci2的植物脂肪酸或其他特殊选定的天然脂肪酸形成的辛酸/癸酸甘油二酯、甘油三酯混合物;可能亦含有羟基的饱和或不饱和脂肪酸的偏甘油酯混合物;Cs-do脂肪酸的甘油单酯及甘油二酯;脂肪酸酯,诸如硬脂酸乙酯、己二酸二正丁酯、月桂酸己酯、二丙二醇壬酸酯;具有中等链长的分支链脂肪酸与链长C_{16}-C_{18}的饱和脂肪醇形成的酯;肉豆蔻酸异丙酯;棕榈酸异丙酯;链长C_{12}-C_{18}的饱和脂肪醇的辛酸酯/癸酸酯;硬脂酸异丙酯;油醇油酸酯;油酸癸酯;油酸乙酯;乳酸乙酯;蜡状脂肪酸酯,诸如合成鸭尾脂腺脂肪、邻苯二甲酸二丁酯、己二酸二异丙酯及与后者相关的酯混合物;脂肪醇,诸如异十三烷醇、2-辛基十二烷醇、十六烷基硬脂醇、油醇;及脂肪酸,诸如油酸;及其混合物。

[0430] 合适的乳化剂为:非离子型界面活性剂,例如聚乙氧基化蓖麻油(polyethoxylated castor oil,)、聚乙氧基化脱水山梨糖醇单油酸酯(polyethoxylated sorbitan monooleate)、脱水山梨糖醇单硬脂酸酯(sorbitan monostearate)、单硬脂酸甘油酯(glycerol monostearate)、硬脂酸聚氧乙酯(polyoxyethyl stearate)、烷基苯酚聚乙二醇醚(alkylphenol polyglycol ether);两性界面活性剂,诸如N-月桂基-对亚胺基二丙酸二钠(di-sodium N-lauryl-p-iminodipropionate)或卵磷脂。

[0431] 合适的阴离子型界面活性剂为:月桂基硫酸钠、脂肪醇醚硫酸酯、单/二烷基聚乙二醇醚正磷酸酯单乙醇胺盐(mono/dialkyl polyglycol ether orthophosphoric acid ester monoethanolamine salt);合适的阳离子活性界面活性剂为:氯化十六烷基三甲基铵。

[0432] 合适的其他助剂为:增强黏度且稳定乳液的物质,诸如羧甲基纤维素、甲基纤维素及其他纤维素及淀粉衍生物、聚丙烯酸酯、海藻酸盐、明胶、阿拉伯胶(gum arabic)、聚乙烯吡咯啶酮、聚乙烯醇、甲基乙烯基醚与顺丁烯二酸酐的共聚物、聚乙二醇、蜡、胶状硅酸或所提及物质的混合物。

[0433] 悬浮液可经口或表面/经皮投予。其藉由将活性化合物悬浮于悬浮剂中、适当时经由添加诸如湿润剂、着色剂、生物吸收促进物质、防腐剂、抗氧化剂、光稳定剂的其他助剂来制备。

[0434] 液体悬浮剂为所有的均质溶剂及溶剂混合物。

[0435] 合适的湿润剂(分散剂)为上文所列的乳化剂。

[0436] 可提及的其他助剂为上文所列的助剂。

[0437] 半固体配制品可经口或表面/经皮投予。其与上述悬浮液及乳液不同之处仅在于其更高的黏度。

[0438] 制备固体配制品时,将活性化合物与合适的赋形剂混合(适当时经由添加助剂)且使其达成期望的形式。

[0439] 合适的赋形剂为生理上可耐受的所有固体惰性物质。所用赋形剂为无机或有机物质。无机物质为例如氯化钠、碳酸盐(诸如碳酸钙)、碳酸氢盐、氧化铝、氧化钛、硅酸、黏土、沈淀硅石或胶状硅石或磷酸盐。有机物质为例如糖、纤维素、食物及饲料(诸如奶粉、动物粕粉、谷粕粉及谷屑)、淀粉。

[0440] 合适的助剂为上文已提及的防腐剂、抗氧化剂及/或着色剂。

[0441] 其他合适的助剂为润滑剂及助流剂,诸如硬脂酸镁、硬脂酸、滑石、膨润土;崩解促进物质,诸如淀粉或交联聚乙烯吡咯啶酮;黏合剂,诸如淀粉、明胶或线性聚乙烯吡咯啶酮;及无水黏合剂,诸如微晶纤维素。

[0442] 一般而言,“杀寄生虫有效量”(parasiticidally effective amount)意谓对生长达成可观察的效应所需的活性成分的量,所述效应包括死亡、延迟、预防、移除及破坏或以其他方式减少目标生物体的出现及活性的效应。本发明所使用的各种化合物/组成物的杀寄生虫的有效量可变化。杀寄生虫的有效量的组成物亦将根据主要条件(诸如期望的杀寄生虫效应及持续时间、目标物种、施加模式及其类似条件)而变化。可用于本发明的组成物一般包含约0.001%至95%的本发明的化合物。

[0443] 一般而言,宜以每天0.5mg/kg至100mg/kg、较佳地每天1mg/kg至50mg/kg的总量施加本发明的化合物。即用配制品含有浓度为10ppm至80重量%、较佳地为0.1重量%至65重量%、更佳地为1重量%至50重量%、最佳地为5重量%至40重量%的作用于寄生虫、较佳地作用于外寄生虫的化合物。使用前稀释的配制品含有浓度为0.5重量%至90重量%、较佳地为1重量%至50重量%的作用于外寄生虫的化合物。此外,配制品包含浓度为10ppm至2重量%、较佳地为0.05重量%至0.9重量%、尤其较佳地为0.005重量%至0.25重量%的对抗内寄生虫的本发明的化合物。

[0444] 在一实施例中,包含本发明的化合物的组成物经皮/表面施加。

[0445] 在另一实施例中,表面施加是呈含有化合物的成形物品形式(诸如套环、圆片、耳标、固定于身体部分上的条带及黏着条及箔)进行。

[0446] 一般宜施加在三周期间释放总量为每公斤所治疗动物体重10mg至300mg、较佳地为20mg至200mg、最佳地为25mg至160mg的本发明的化合物的固体制剂。

[0447] 制备成形物品时,使用热塑性及可挠性塑料以及弹性体及热塑性弹性体。合适的塑料及弹性体为与本发明的化合物充分兼容的聚乙烯树脂、聚胺基甲酸酯、聚丙烯酸酯、环氧树脂、纤维素、纤维素衍生物、聚酰胺及聚酯。塑料及弹性体的详细列表以及成形物品的制备程序列于例如PCT专利公开号WO 2003/086075中。

[0448] 数字科技

[0449] 本发明的化合物可与模型组合使用,例如嵌入计算机程序中,以用于特定地点的

农作物管理、卫星耕种(satellite farming)、精准耕种或精准农业。此类模型支持来自各种来源(例如土壤、天气、农作物(例如品种、生长阶段、植物健康)、杂草(例如品种、生长阶段)、疾病、害虫、养分、水、湿度、生物量、卫星数据、产量等)的资料,以达到优化盈利、可持续性及环境保护的目的。尤其地,此类模型有助于优化农艺决策、控制农药施用的精确度并记录所进行的工作。

[0450] 举例来说,若一模型仿真害虫的发展并计算出已达到可推荐将本发明的化合物应用至农作物的门坎值时,可根据适当的剂量方案,将本发明的化合物应用到该农作物上。

[0451] 包括农艺模型的市售系统例如为来自The Climate Corporation的FieldScriptsTM、来自BASF的XarvioTM、来自John Deere的AGLogicTM等。

[0452] 本发明的化合物也可与智能喷涂设备组合使用,例如附加在或安装在农用车辆(例如拖拉机、机器人、直升机、飞机、无人驾驶飞行器(UAV)(例如无人机等))上的点喷洒(spot spraying)或精密喷洒设备。此种设备通常包括输入传感器(例如照相机)及处理单元,上述处理单元被配置为分析输入数据,并被配置为基于对输入数据的分析提供决定,以将本发明的化合物以特定且精确的方式应用于农作物(分别是杂草)。使用此种智能喷洒设备通常还需要定位系统(例如GPS接收器)来定位记录的数据并引导或控制农用车辆;还需要地理信息系统(geographic information systems,GIS)以在可理解的地图上表示信息,以及还需要适当的农用车辆,以执行所需的农业行动(例如喷洒)。

[0453] 在一实例中,可从相机取得的图像中检测到害虫。在一实例中,可基于该图像识别及/或分类有害生物。此种识别及/或分类可利用图像处理算法。此种图像处理算法可利用机器学习算法,例如经过训练的神经网络、判定树,并利用人工智能算法。以此种方式,本文所述的化合物可仅在需要时应用。

[0454] 正向作物反应:

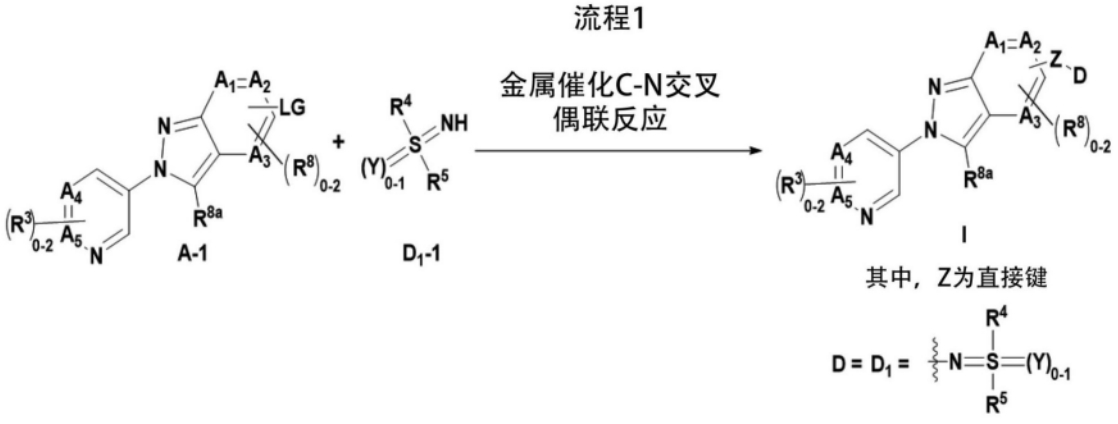
[0455] 本发明的化合物不仅有效地控制昆虫及螨虫害虫,而且表现出正向积极的作物反应,例如植物生长促进效果(诸如增强根系生长以及增强对干旱、高盐、高温、寒冷、霜冻或光辐射的耐受性)、提高开花、提高养分利用(例如提高氮同化(nitrogen assimilation))、提高植物产品的质量、增加生产性分蘖(tiller)数量、增强对昆虫害虫等的抗性,从而提高产量。

[0456] 一般合成流程:

[0457] 现在将通过以下实例进一步详细说明本发明,但不对其施加任何限制。

[0458] 流程-1:

[0459] 流程1



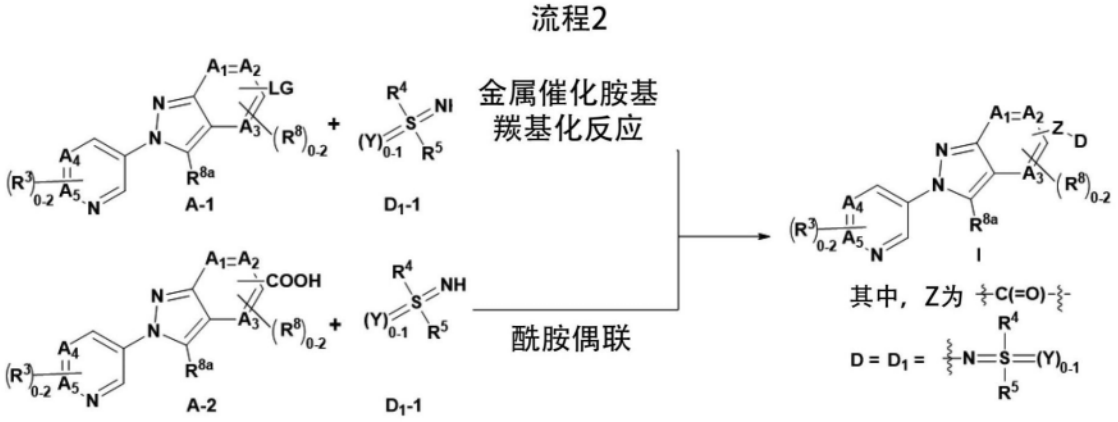
[0460] 在其中一个较佳实施例中,式(I)化合物(其中D代表D_1且Z为直接键),可通过金属催化交叉偶联反应在式A-1化合物(其中LG代表离去基)以及式D_1-1的化合物之间,依循文献US 20190297887以及其中所进一步引用的文献中描述的流程制备。式D_1-1的化合物可于市场上购得或者藉由Chem.Eur.J.2021,27,17293-17321、European Journal of Medicinal Chemistry2017,126,225-245、Chem.Commun.,2017,53,348-351、J.Am.Chem.Soc.2020,142(36),15445-15453以及其中所进一步引用的文献所描述的方法制备。除非另外说明,各变量的定义如上述式(I)化合物。

[0461] C-N偶联反应通常是在溶剂的存在下进行的,可用于该反应的溶剂没有特别的限制,只要它不会对反应产生不利影响。例如,醚类(如二恶烷、四氢呋喃、乙二醇、二甲醚及二乙二醇二甲醚)、芳香烃类(如苯、甲苯及二甲苯)、N-酰胺(如N,N-二甲基甲酰胺、N-二甲基乙酰胺及1-甲基-2-吡咯烷酮)、醇类(如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、2-丙醇及2-甲基-2-丙醇)、腈类(如乙腈)或水或其混合物可用于此目的。较佳的溶剂包括芳香烃(如甲苯及二甲苯)以及酰胺(如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺及1-甲基-2-吡咯烷酮);其中N,N-二甲基甲酰胺及甲苯是最佳的。该反应是在选自但不限于以下的碱的存在下进行:金属烷氧基化物(如甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾及叔丁醇钠)、无机碱(如氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸钠、碳酸钾、碳酸铯、磷酸钠、磷酸二氢钾及氢化钾)、有机碱(如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺及吡啶)。较佳的碱包括金属烷氧基化物(如叔丁醇钾及叔丁醇钠)。可用于该反应的钯催化剂包括但不限于:钯碳(palladium-carbon)、无机钯盐(如氯化钯)、有机钯错合物(如醋酸钯、四(三苯基膦)钯(0)(tetrakis(triphenylphosphine)palladium(0))、双三苯基膦二氯化钯(II)(bis(triphenylphosphine)palladium(II)chloride)、1,1'-双(二苯基膦)苯基二氯化钯(II)(1,1'-bis(diphenylphosphino)phenylpalladium(II)chloride)以及三(二亚基苯甲基丙酮)二钯(0)(tris(dibenzylidene acetone)dipalladium(0)))以及聚合物固定化的有机钯错合物(如聚合物支持的双(乙酰)三苯基膦钯(II)及聚合物携带的二(乙酰)二环己基膦钯(II))。钯催化剂,如氯化钯、乙酸钯、四(三苯基膦)钯(0)、双(三苯基膦)氯化钯(II)、1,1'-双(二苯基膦)苯基二氯化钯(II)以及三(二亚基苯甲基丙酮)二钯(0)是更佳的。可用于此反应的配位基的实例包括但不限于:三(邻甲苯基)膦(tris(o-tolyl)phosphine)、三环己基膦(tricyclohexylphosphine)、三叔丁基磷四氟硼酸盐(tri-tert-butylphosphonium tetrafluoroborate)、(伸氧基二-2,1-亚苯基)双[二环己基]膦((oxydi-2,1-phenylene)bis[dicyclohexyl]phosphine)、4,5-双(二苯基膦)-9,9-二甲基氧杂蒽(4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanthene)、2-二环己基膦-2'-(N,N-二甲基胺基)联苯(2-dicyclohexylphosphino-2'-(N,N-dimethylamino)biphenyl)、2-二环己基膦-2',4',6'-三异丙基联苯(2-dicyclohexylphosphino-2',4',6'-triisopropylbiphenyl)、2-二环己基膦-2',6'-二甲氧基联苯(2-dicyclohexylphosphino-2',6'-dimethoxybiphenyl)、2-二环己基膦-2',6'-二异丙氧基联苯(2-dicyclohexylphosphino-2',6'-diisopropoxybiphenyl)、2-二叔丁基膦-2',4',6'-三异丙基联苯(2-di-tert-butylphosphino-2',4',6'-triisopropylbiphenyl)、2-二叔丁基膦-3,4,5,6-四甲基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯(2-di-tert-butylphosphino-3,4,5,6-tetramethyl-2',4',6'-triisopropyl-1,1'-biphenyl)、(2-联苯)二叔丁基磷((2-biphenylyl)di-tert-butylphosphine)、2-(二叔丁基膦)联苯(2-(di-tert-

butylphosphino)biphenyl)、2-二叔丁基膦-3,4,5,6-四甲基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯(2-di-tert-butylphosphino-3,4,5,6-tetramethyl-2',4',6'-triisopropyl-1,1'-biphenyl)、1,1'-二茂铁-双(二苯基膦)(1,1'-ferrocenediyl-bis(diphenylphosphine))、2-二叔丁基膦-2'-甲基联苯(2-di-tert-butylphosphino-2'-methylbiphenyl)、2-甲基-2'-二环己基膦联苯(2-methyl-2'-dicyclohexylphosphinobiphenyl)以及[1,1'-联苯]-3-磺酸([1,1'-biphenyl]-3-sulfonic acid)、2'-(二环己基膦)-2,6-二甲氧基-钠盐(2'-(dicyclohexylphosphino)-2,6-dimethoxy-sodium salt)。较佳的配位基包括2-(二叔丁基膦)联苯(2-(di-tert-butylphosphino)biphenyl)、2-二叔丁基膦-3,4,5,6-四甲基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯(2-di-tert-butylphosphino-3,4,5,6-tetramethyl-2',4',6'-triisopropyl-1,1'-biphenyl)、(伸氧基二-2,1-苯基)双[二环己基]膦((Oxydi-2,1-phenylene)bis[dicyclohexyl]phosphine)、1,1'-二茂铁-双(二苯基膦)(1,1'-ferrocenediyl-bis(diphenylphosphine)以及4,5-双(二苯基膦)-9,9-二甲基氧杂蒽(4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanthene)。

[0462] 该反应可以在0-200℃的温度范围内进行,最好是在50-150℃的温度范围内进行,持续时间在30分钟到24小时之间。

[0463] 流程-2:

[0464] 

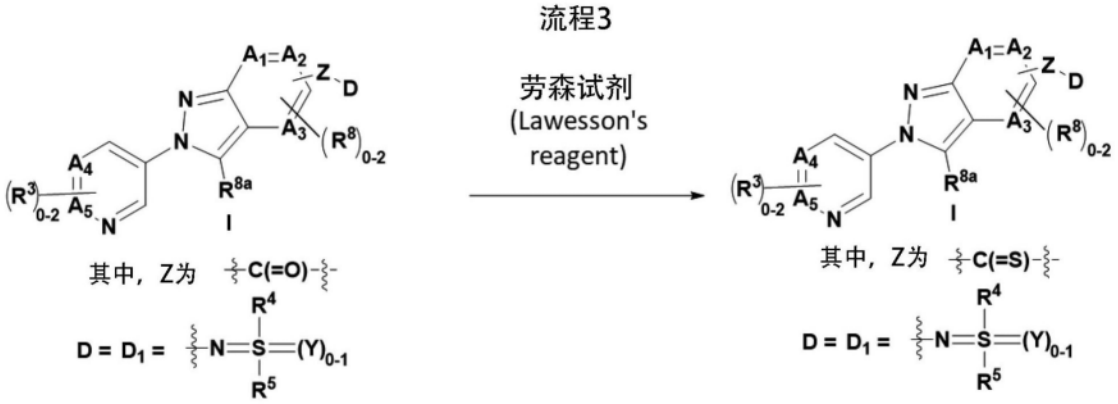
[0465] 在另一较佳实施例中,式(I)化合物(其中D代表D_1且Z为-C=O),可通过金属催化的胺基羰基化反应或者式A-1C化合物(A-2为酰胺偶联反应)(其中LG代表离去基)与式D_1-1的化合物之间酰胺偶联反应,依循文献WO2016144351、Chem.Eur.J.2021,27,17293-17321以及其中所进一步引用的文献中描述的流程制备。式D_1-1的化合物可于市场上购得或者藉由Chem.Eur.J.2021,27,17293-17321、European Journal of Medicinal Chemistry 2017,126,225-245、Chem.Commun.,2017,53,348-351、J.Am.Chem.Soc.2020,142(36),15445-15453以及其中所进一步引用的文献所描述的方法制备。除非另外说明,各变量的定义是如上述式(I)化合物。

[0466] 金属催化的胺基羰基化反应,如流程2所描绘的,在一溶剂的存在下进行,该溶剂例如,但不限于N-酰胺,举例来说:N,N-二甲基甲酰胺、N-二甲基乙酰胺以及1-甲基-2-吡咯烷(1-methyl-2-pyrrolidone);N,N-二甲基甲酰胺是较佳的溶剂。在此反应中作为"CO替代物(surrogate)"的金属六羰基选自但不限于六羰基钼以及六羰基钨。反应于一碱的存在下进行,该碱选自但不限于金属氢化物(例如氢化钠、氢化锂以及氢化钾)、金属碳酸盐(例如

碳酸钠、碳酸钾、碳酸铯)、有机胺盐(例如三乙基胺、N,N-二异丙基乙基胺、1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯(1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene);较佳地在有机胺(例如、N,N-二异丙基乙基胺以及1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯(1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene))的存在下进行。可以使用在此反应的催化剂包括,例如但不限于有机钯错合物(例如聚合物支持的双(乙酰)三苯基膦钯(II)、反式-二-μ-乙酰基双[2-(双2-甲基苯基)膦]苯甲基]二钯(trans-di-μ-acetatobis[2-[bis(2-methylphenyl)phosphino]benzyl]dipalladium)及聚合物携带的二(乙酰)二环已基膦钯(II))。用于该反应的配位基的一个例子是四氟硼酸三叔丁基磷(tri-tert-butylphosphonium tetrafluoroborate)。该反应通常在0-200℃的温度范围内进行,最好是50-180℃,持续时间在30分钟到24小时之间。该反应也可以选择在微波辐射条件下进行。

[0467] 酰胺偶联反应,如流程2所描绘的,通常在一溶剂的存在下进行,该溶剂例如,但不限于N-酰胺,举例来说:N,N-二甲基甲酰胺、N-二甲基乙酰胺以及1-甲基-2-吡咯烷(1-methyl-2-pyrrolidone);N,N-二甲基甲酰胺是较佳的溶剂。此外,这些反应于一碱的存在下进行,该碱选自但不限于有机胺盐(例如三乙基胺、N,N-二异丙基乙基胺、1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯(1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene);三乙基胺及N,N-二异丙基乙基胺为较佳的碱。可以使用在此反应的偶联剂为,但不限于:N,N′-二环已基碳二亚胺(N,N′-dicyclohexylcarbodiimide)、1-[3-(二甲基胺基)丙基]-3-乙基碳二亚胺碘甲烷盐(1-[3-(dimethylamino)propyl]-3-ethylcarbodiimide methiodide)、1-羟基苯三唑水合物(1-hydroxybenzotriazole hydrate)、1-[双(二甲基胺基)亚甲基]-1H-1,2,3-三唑并[4,5-b]吡啶鎓3-氧化物六氟磷酸盐(1-[bis(dimethylamino)methylene]-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]pyridinium 3-oxid hexafluorophosphate)以及N-[(二甲基胺基)-1H-1,2,3-三唑并[4,5-b]吡啶-1-亚甲基]-N-甲基胺基六氟磷酸盐N-氧化物(N-[(dimethylamino)-1H-1,2,3-triazolo-[4,5-b]pyridin-1-ylmethylene]-N-methylmethanaminium hexafluorophosphate N-oxide)。该反应可以在0-200℃的温度范围内进行,最好是0-50℃,持续时间在30分钟到24小时之间。

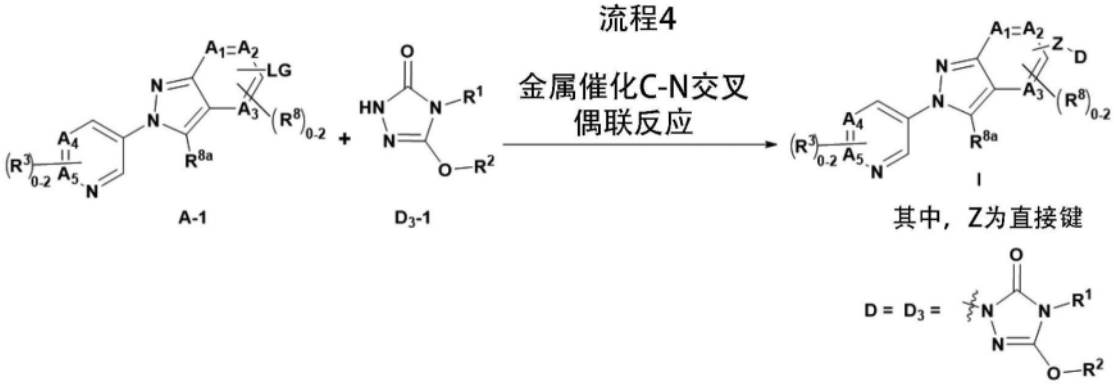
[0468] 流程-3:

[0469] 

[0470] 在另一较佳实施例中,式(I)化合物(其中D代表D_1且Z为-C=S),可由式(I)化合物(其中D代表D_1且Z代表-C=O),在合适的硫酰化反应条件下,在劳森试剂(LawessoN's reagent)的存在下制备,如文献Chem.Sci.,2021,12,6393-6405以及其中另外引用的文献中所描述。除非另外说明,各变量的定义如上述式(I)化合物。硫酰化反应,如流程3所描绘,

于一溶剂的存在下进行,该溶剂例如,但不限于芳香烃(例如苯、甲苯以及二甲苯),较佳于甲苯存在下。该反应可以在0-200℃的温度范围内进行,最好是50-150℃,持续时间在30分钟到24小时之间。

[0471] 流程-4:

[0472] 

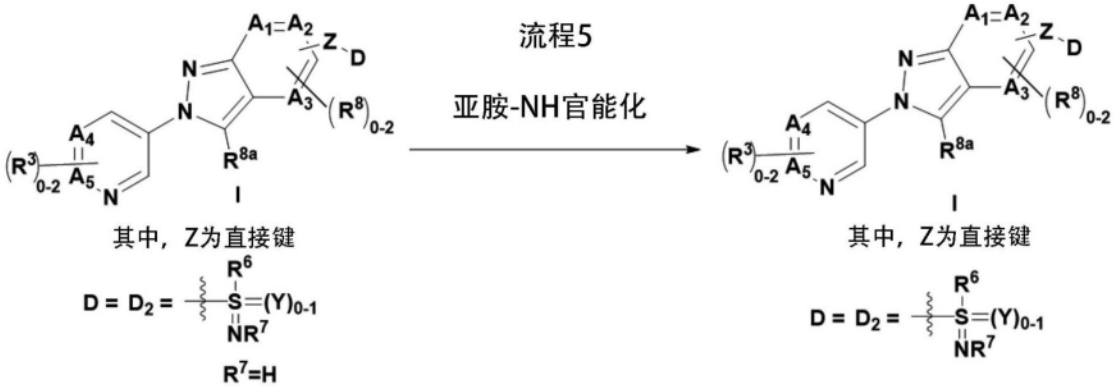
[0473] 在另一较佳实施例中,式(I)化合物(其中D代表D_3且Z为直接键),可通过式A-1化合物(其中LG代表离去基)以及式D_3-1的烷氧三唑酮(alkoxytrizolones)之间的金属催化偶联反应,依循文献US20190297887以及其中所进一步引用的文献中描述的流程制备。式D_3-1的烷氧三唑酮(alkoxytrizolones)可于市面上获得或者藉由美国专利公开号US005606070A以及其中所进一步引用的文献所描述的方法制备。除非另外说明,各变量的定义如上述式(I)化合物。

[0474] 反应是在一溶剂的存在下进行的,该溶剂例如但不限于醚类(例如二恶烷、四氢呋喃、2-甲基四氢呋喃、乙二醇二甲醚以及二乙二醇二甲醚)、芳香烃类(例如苯、甲苯以及二甲苯)、N,N-二甲基甲酰胺、N-酰胺(例如N-二甲基乙酰胺以及1-甲基-2-吡咯烷酮)、醇类(例如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、2-丙醇、2-甲基-2-丙醇以及2-甲基-2-丁醇)、腈类(如乙腈)以及水或其混合物。较佳的溶剂包括酰胺类(例如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺以及1-甲基-2-吡咯烷酮)以及醇类(例如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、2-丙醇、2-甲基-2-丙醇以及2-甲基-2-丁醇);N,N-二甲基甲酰胺以及2-甲基-2-丁醇。

[0475] 可用于该反应的碱包括但不限于金属烷氧基化物(如甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾以及叔丁醇钠)、无机碱(如氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸钠、碳酸钾、碳酸铯、磷酸钠、磷酸钾、磷酸二氢钾以及氢化钾)以及有机碱(如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺以及吡啶)。较佳的碱包括磷酸盐(如磷酸钠、磷酸钾、磷酸氢钾)以及碳酸盐(如碳酸钠、碳酸钾以及碳酸铯);其中碳酸盐,如碳酸钠、碳酸钾以及碳酸铯是更佳的碱。可用于该反应的钯催化剂包括但不限于:钯碳(palladium-carbon)、无机钯盐(如氯化钯)、有机钯错合物(如醋酸钯、四(三苯基膦)钯(0)(tetrakis(triphenylphosphine)palladium(0))、双三苯基膦二氯化钯(II)(bis(triphenylphosphine)palladium(II)chloride)、1,1'-双(二苯基膦)苯基二氯化钯(II)(1,1'-bis(diphenylphosphino)phenylpalladium(II)chloride)以及三(二亚基苯甲基丙酮)二钯(0)(tris(dibenzylidene acetone)dipalladium(0)))以及聚合物固定化的有机钯错合物(如聚合物支持的双(乙酰)三苯基膦钯(II)及聚合物携带的二(乙酰)二环已基膦钯(II))。钯催化剂,如氯化钯、乙酸钯、四(三苯基膦)钯(0)、双(三苯基膦)氯化钯(II)、1,1'-双(二苯基膦)苯基二氯化钯(II)以及三(二亚基苯甲基丙酮)二钯(0)是更佳的。可用于此反应的配位基实例包括但不限于:三(邻甲苯基)膦(tris(o-tolyl)phosphine)、三环已

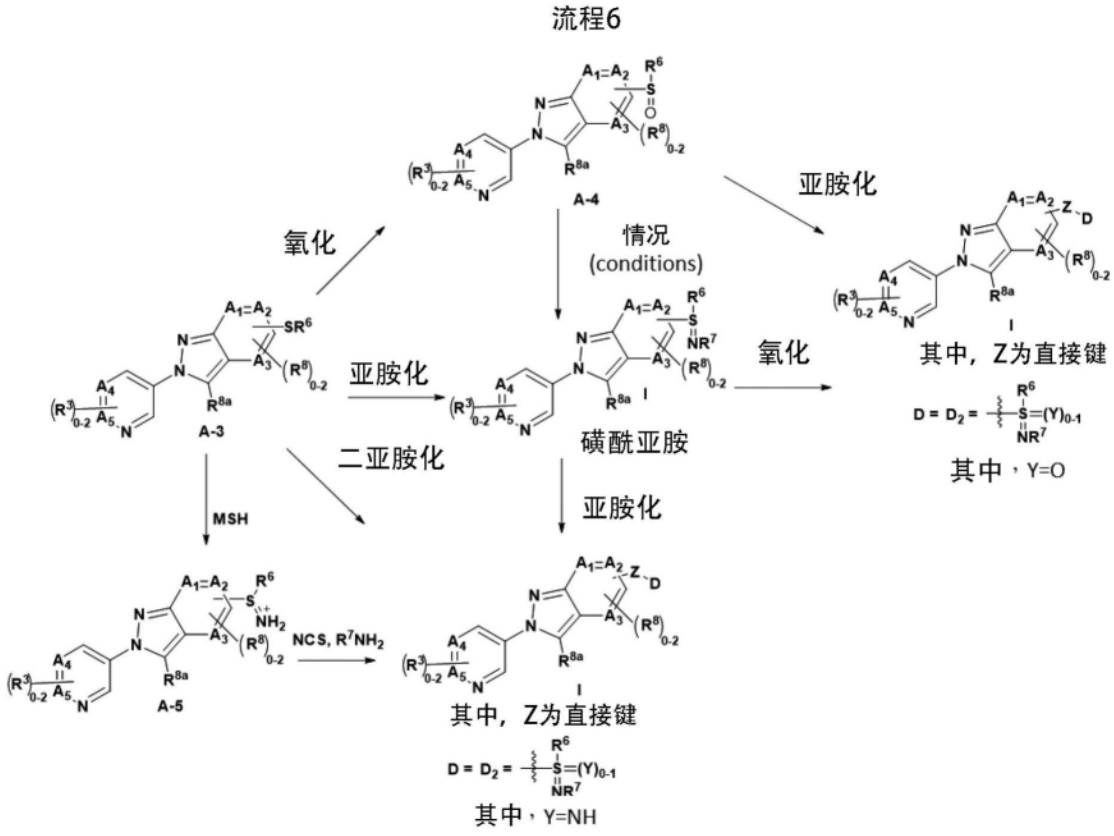
基膦(tricyclohexylphosphine)、三叔丁基磷四氟硼酸盐(tri-tert-butylphosphonium tetrafluoroborate)、(伸氧基二-2,1-亚苯基)双[二环己基]膦((oxydi-2,1-phenylene) bis[dicyclohexyl]phosphine)、4,5-双(二苯基膦)-9,9-二甲基氧杂蒽(4,5-bis (diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanthene)、2-二环己基膦-2'-(N,N-二甲基胺基)联苯(2-dicyclohexylphosphino-2'-(N,N-dimethylamino)biphenyl)、2-二环己基膦-2',4',6'-三异丙基联苯(2-dicyclohexylphosphino-2',4',6'-triisopropylbiphenyl)、2-二环己基膦-2',6'-二甲氧基联苯(2-dicyclohexylphosphino-2',6'-dimethoxybiphenyl)、5-(二叔丁基膦)-1',3',5'-三苯基-1'H-[1,4']联吡唑(5-(di-tert-butylphosphino)-1',3',5'-triphenyl-1'H-[1,4']bipyrazole)、5-(二环己基膦)-1',3',5'-三苯基-1'H-[1,4']联吡唑(5-(dicyclohexylphosphino)-1',3',5'-triphenyl-1'H-[1,4']bipyrazole)、5-[二(1-金刚烷)膦]-1',3',5'-三苯基-1'H-[1,4']联吡唑(5-[di(1-adamantyl)phosphino]-1',3',5'-triphenyl-1'H-[1,4']bipyrazole)、2-二环己基膦-2',6'-二异丙氧基联苯(2-dicyclohexylphosphino-2',6'-diisopropoxybiphenyl)、2-二叔丁基膦-2',4',6'-三异丙基联苯(2-di-tert-butylphosphino-2',4',6'-triisopropylbiphenyl)、2-二叔丁基膦-3,4,5,6-四甲基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯(2-di-tert-butylphosphino-3,4,5,6-tetramethyl-2',4',6'-triisopropyl-1,1'-biphenyl)、(2-联苯)二叔丁基磷((2-biphenylyl)di-tert-butylphosphine)、2-(二叔丁基膦)联苯(2-(di-tert-butylphosphino)biphenyl)、2-二叔丁基膦-3,4,5,6-四甲基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯(2-di-tert-butylphosphino-3,4,5,6-tetramethyl-2',4',6'-triisopropyl-1,1'-biphenyl)、1,1'-二茂铁-双(二苯基膦)(1,1'-ferrocenediyl-bis(diphenylphosphine))、2-二叔丁基膦-2'-甲基联苯(2-di-tert-butylphosphino-2'-methylbiphenyl)、2-甲基-2'-二环己基膦联苯(2-methyl-2'-dicyclohexylphosphinobiphenyl)、[1,1'-联苯]-3-磺酸([1,1'-biphenyl]-3-sulfonic acid)、2'-(二环己基膦)-2,6-二甲氧基-钠盐(2'-(dicyclohexylphosphino)-2,6-dimethoxy-sodium salt)。较佳的配位基包括2-(二叔丁基膦)联苯(2-(di-tert-butylphosphino)biphenyl)、5-(二叔丁基膦)-1',3',5'-三苯基-1'H-[1,4']联吡唑(5-(di-tert-butylphosphino)-1',3',5'-triphenyl-1'H-[1,4']bipyrazole)、5-(二环己基膦)-1',3',5'-三苯基-1'H-[1,4']联吡唑(5-(dicyclohexylphosphino)-1',3',5'-triphenyl-1'H-[1,4']bipyrazole)、5-[二(1-金刚烷)膦]-1',3',5'-三苯基-1'H-[1,4']联吡唑(5-[di(1-adamantyl)phosphino]-1',3',5'-triphenyl-1'H-[1,4']bipyrazole)、1,1'-二茂铁-双(二苯基膦)(1,1'-ferrocenediyl-bis(diphenylphosphine))以及4,5-双(二苯基膦)-9,9-二甲基氧杂蒽(4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanthene)。该反应可以在0-200℃的温度范围内进行,较佳是50-150℃,持续时间在30分钟到24小时之间。

[0476] 流程-5:

[0477] 

[0478] 在另一较佳实施例中,式(I)化合物(其中D代表D_2、Z为直接键且R^7代表氢),可通过例如N-(卤)烷基化、N-(杂)芳烃化、N-酰化、N-酰胺化、N-卤化以及N-腈化的反应,在其亚胺基(-NH)的官能基上衍生化而形成式(I)化合物(其中D代表D_2、Z为直接键且R^7代表其一般意涵但排除氢),以下的合适方法如文献中所描述,例如European Journal of Medicinal Chemistry 2017,126,225-245、Org.Lett.2015,17,12,3166-3169、Tetrahedron Letters 56(2015)7056-7058、Eur.J.Org.Chem.2012,20,3737-3741以及PCT专利公开号WO2019150219以及其中所进一步引用的文献。除非另外说明,各变量的定义如上所述。

[0479] 流程-6:

[0480] 

[0481] 在另一个较佳的实施例中,可以从式A-3化合物开始,依照文献中描述的流程(例如European Journal of Medicinal Chemistry 2017,126,225-245以及Chem.Commun.,2017,53,348-351以及其中进一步引用的文献),制备由式(I)所代表的各种含硫代表物(其中D代表D_2、Z是直接键且R^7如上述定义),例如但不限于:亚磺酰亚胺(sulfoximines)、磺酰亚胺(sulfilimines)以及磺酰二亚胺(sulfondiimides)。除非另外说明,各变量的定义如

上述式(I)化合物。式(I)的磺酰亚胺可以从式A-3的硫化物在胺基甲酸铵及二乙酰氧基碘苯(diacetoxyiodobenzene)的存在下开始制备(例如,参照Angew.Chem.Int.Ed.2016,55,7203-7207)。可替代的,磺酰亚胺(I)也可以由亚磺酰亚胺(I)的氧化制备(例如,参照Chem.Rev.1977,77,409-435)。另一方面,式(I)的磺酰亚胺可由式(A-3)的硫化物通过使用亲电性胺化试剂,如O-(均三甲苯磺酰基)羟胺(O-(mesitylsulfonyl)hydroxylamine,MSH)或O-(2,4-二硝基苯基)羟胺(O-(2,4-dinitrophenyl)hydroxylamine,DPH),按照文献中描述的流程获得,例如Angew.Chem.Int.Ed.2012,51,4440-4443及其中进一步引用的文献。式(I)的亚磺酰亚胺也可由式(A-4)的硫化物通过亚胺化制备,方法是:a)使用伯格斯型(Burgess-type)试剂,如文献中所述,例如Adv.Catal.2013,355,3363-3368及其中进一步引用的文献,或b)在亲电胺化试剂存在下的铑催化条件,例如但不限于O-(均三甲苯磺酰基)羟胺(MSH)或O-(2,4-二硝基苯基)羟胺(DPH)),如文献中所述,例如在Chem.Commun.,2014,50,9687-9689及其中进一步引用的文献中描述。式(I)的磺酰二亚胺可以通过以下方法合成:a)直接亚胺化式A-3的硫化物,如文献中所述,例如在Chem.Ber.1984,117,2779-2784及其中进一步引用的文献,或b)如文献中所述的式(I)的磺酰亚胺的亚胺化,例如在Angew.Chem.Int.Ed.2012,51,4440-4443及其中进一步引用的文献,或c)使用N-氯琥珀酰亚胺及胺对式A-5所代表的磺酰亚胺盐进行亚胺化,如文献中所述,例如Angew.Chem.Int.Ed.2012,51,4440-4443及其中进一步引用的文献。

[0482] 根据本发明的特征,式A-3化合物(其中所有取代基如前所定义),可由流程7、流程8、流程9或实验例中所公开的方法制备。代表性的流程如下所示;然而,本公开内容不应解释为限制合成式A-3化合物的范围。

[0483] 流程-7:

[0484] 

[0485] 根据流程7,由式A-3所代表的化合物可以通过PCT专利公开号WO2020257145及其中进一步引用的文献中所述的式A-1化合物及式R^6SH的硫醇之间的碱介导且金属催化的C-S偶联反应制备。式中R^6SH的硫醇可从市面上获得。除非另有说明,各变量A_1、A_2、A_3、A_4、A_5、R^3、R^6、R^8以及R^{8a}的定义如上所述。LG代表离去基团,如卤素或甲苯磺酸盐。

[0486] C-S偶联的一般规程:该反应通常是在一溶剂的存在下,例如,醚类(如二恶烷、四氢呋喃、2-甲基-四氢呋喃、甲撑二甲醚(methylene glycol dimethyl ether)及二乙二醇二甲醚(diethylene glycol dimethyl ether))、芳香烃类(如苯、甲苯及二甲苯)、N-酰胺(如N,N-二甲基甲酰胺、N-二甲基乙酰胺及1-甲基-2-吡咯烷酮)、醇类(如甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、2-丙醇、2-甲基-2-丙醇及2-甲基-2-丁醇)、腈类(如乙腈)或水或其混合物。较佳的溶剂包括酰胺(如N,N-二甲基甲酰胺、N,N-二甲基乙酰胺及1-甲基-2-吡咯烷酮)以及芳香烃(如苯、甲苯及二甲苯);其中N,N-二甲基甲酰胺及甲苯是最佳的。该反应是在一碱的存在下进行,该碱选自但不限于以下:金属烷氧基化物(如甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾及叔丁醇钠)、无机碱(如氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸钠、碳酸钾、碳酸铯、磷酸钠、磷酸钾、磷酸二氢钾及氢

化钾)、有机碱(如三乙胺、N,N-二异丙基乙胺及吡啶)。较佳的碱包括金属烷氧基化物(如甲醇钠、乙醇钠、叔丁醇钾、叔丁醇钠)以及碳酸盐(如碳酸钠、碳酸钾以及碳酸铯);其中碳酸盐(如碳酸铯)及金属烷氧基化物(如叔丁醇钾及叔丁醇钠)是更佳的碱。可用于该反应的钯催化剂为但不限于:钯碳(palladium-carbon)、无机钯盐(如氯化钯)、有机钯错合物(如醋酸钯、四(三苯基膦)钯(0)(tetrakis(triphenylphosphine)palladium(0))、双三苯基膦二氯化钯(II)(bis(triphenylphosphine)palladium(II)chloride)、1,1'-双(二苯基膦)苯基二氯化钯(II)(1,1'-bis(diphenylphosphino)phenylpalladium(II)chloride)以及三(二亚基苯甲基丙酮)二钯(0)(tris(dibenzylidene acetone)dipalladium(0)))以及聚合物固定化的有机钯错合物(如聚合物支持的双(乙酰)三苯基膦钯(II)及聚合物携带的二(乙酰)二环已基膦钯(II))。钯催化剂,如氯化钯、乙酸钯、四(三苯基膦)钯(0)、双(三苯基膦)氯化钯(II)、1,1'-双(二苯基膦)苯基二氯化钯(II)以及三(二亚基苯甲基丙酮)二钯(0)是更佳的。可用于此反应的配位基实例包括但不限于:三(邻甲苯基)膦(tris(o-tolyl)phosphine)、三环已基膦(tricyclohexylphosphine)、三叔丁基磷四氟硼酸盐(tri-tert-butylphosphonium tetrafluoroborate)、(伸氧基二-2,1-亚苯基)双[二环已基]膦((oxydi-2,1-phenylene)bis[dicyclohexyl]phosphine)、4,5-双(二苯基膦)-9,9-二甲基氧杂蒽(4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanthene)、2-二环已基膦-2'-(N,N-二甲基胺基)联苯(2-dicyclohexylphosphino-2'-(N,N-dimethylamino)biphenyl)、2-二环已基膦-2',4',6'-三异丙基联苯(2-dicyclohexylphosphino-2',4',6'-triisopropylbiphenyl)、2-二环已基膦-2',6'-二甲氧基联苯(2-dicyclohexylphosphino-2',6'-dimethoxybiphenyl)、5-(二叔丁基膦)-1',3',5'-三苯基-1'H-[1,4']联吡唑(5-(di-tert-butylphosphino)-1',3',5'-triphenyl-1'H-[1,4']bipyrazole)、5-(二环已基膦)-1',3',5'-三苯基-1'H-[1,4']联吡唑(5-(dicyclohexylphosphino)-1',3',5'-triphenyl-1'H-[1,4']bipyrazole)、5-[二(1-金刚烷)膦]-1',3',5'-三苯基-1'H-[1,4']联吡唑(5-[di(1-adamantyl)phosphino]-1',3',5'-triphenyl-1'H-[1,4']bipyrazole)、2-二环已基膦-2',6'-二异丙氧基联苯(2-dicyclohexylphosphino-2',6'-diisopropoxybiphenyl)、2-二叔丁基膦-2',4',6'-三异丙基联苯(2-di-tert-butylphosphino-2',4',6'-triisopropylbiphenyl)、2-二叔丁基膦-3,4,5,6-四甲基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯(2-di-tert-butylphosphino-3,4,5,6-tetramethyl-2',4',6'-triisopropyl-1,1'-biphenyl)、(2-联苯)二叔丁基磷((2-biphenylyl)di-tert-butylphosphine)、2-(二叔丁基膦)联苯(2-(di-tert-butylphosphino)biphenyl)、2-二叔丁基膦-3,4,5,6-四甲基-2',4',6'-三异丙基-1,1'-联苯(2-di-tert-butylphosphino-3,4,5,6-tetramethyl-2',4',6'-triisopropyl-1,1'-biphenyl)、1,1'-二茂铁-双(二苯基膦)(1,1'-ferrocenediyl-bis(diphenylphosphine))、2-二叔丁基膦-2'-甲基联苯(2-di-tert-butylphosphino-2'-methylbiphenyl)、2-甲基-2'-二环已基膦联苯(2-methyl-2'-dicyclohexylphosphinobiphenyl)、[1,1'-联苯]-3-磺酸([1,1'-biphenyl]-3-sulfonic acid)、2'-(二环已基膦)-2,6-二甲氧基-钠盐(2'-(dicyclohexylphosphino)-2,6-dimethoxy-sodium salt)。较佳的配位基包括2-(二叔丁基膦)联苯(2-(di-tert-butylphosphino)biphenyl)、5-(二叔丁基膦)-1',3',5'-三苯基-1'H-[1,4']联吡唑(5-

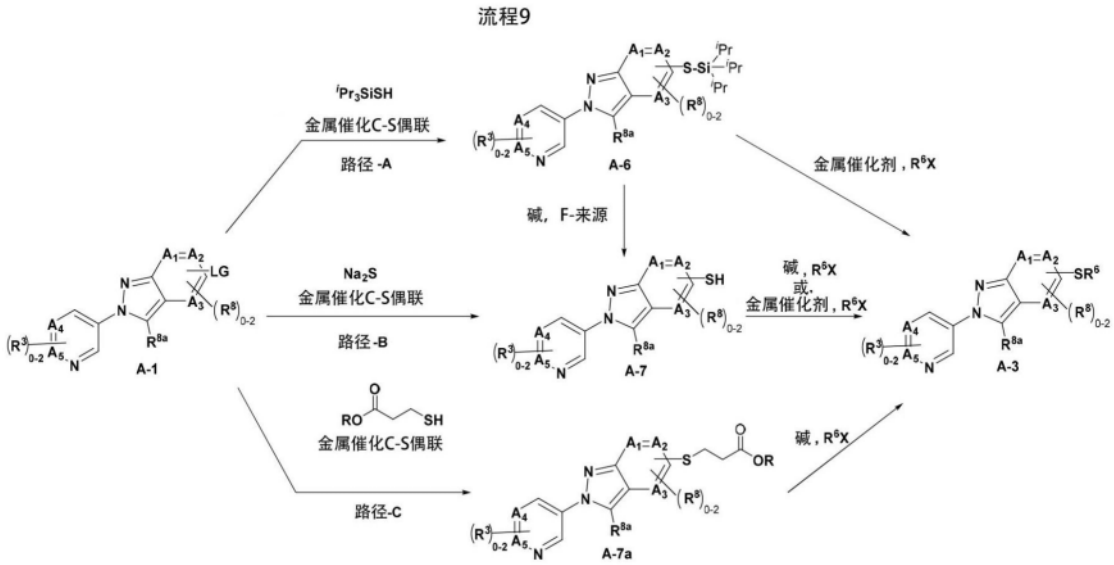
(di-tert-butylphosphino)-1',3',5'-triphenyl-1'H-[1,4']bipyrazole)、5-(二环己基膦)-1',3',5'-三苯基-1'H-[1,4']联吡唑(5-(dicyclohexylphosphino)-1',3',5'-triphenyl-1'H-[1,4']bipyrazole)、5-[二(1-金刚烷)膦]-1',3',5'-三苯基-1'H-[1,4']联吡唑(5-[di(1-adamantyl)phosphino]-1',3',5'-triphenyl-1'H-[1,4']bipyrazole)、1,1'-二茂铁-双(二苯基膦)(1,1'-ferrocenediyl-bis(diphenylphosphine))以及4,5-双(二苯基膦)-9,9-二甲基氧杂蒽(4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanthene)。该反应可以在0-200℃的温度范围内进行,较佳是50-150℃,持续时间在30分钟到24小时之间。

[0487] 流程-8:

[0488] 

[0489] 可替代地,也可以如流程8中所描述的,依照上述"C-S偶联的一般规程",制备式A-3化合物。式A-1化合物及式R^6SM的适当金属硫醇盐可以得到式A-3化合物,如PCT专利公开号WO2020257145中的文献及其中进一步引用的文献所述。分子式为R^6SM的金属硫醇盐(其中M可以是但不限于钠或钾),可以从市面上获得,也可以在用有机及无机碱处理相应的硫醇盐原位生成。除非另有说明,各变量A_1、A_2、A_3、A_4、A_5、R^3、R^6、R^8以及R^{8a}的定义如上。LG代表一个离去基,如卤素或甲苯磺酸盐。

[0490] 流程-9:

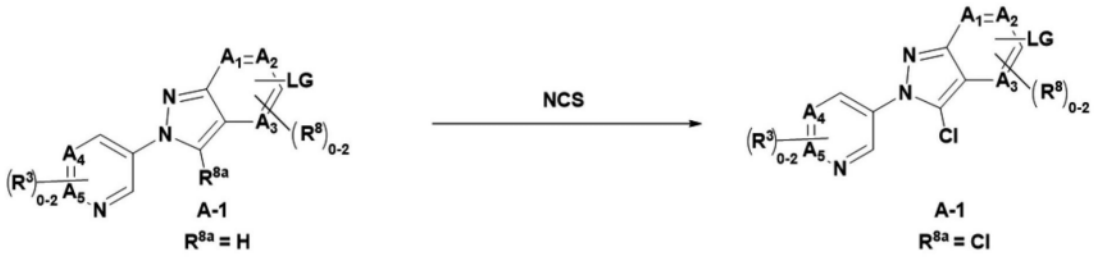
[0491] 

[0492] 在本发明的另一实施例中,式A-3化合物(其中所有取代基如前所定义),可由反应流程9所给定的方法制备。式A-1化合物可以在三烷基硅烷硫醇(如三异丙基硅烷硫醇)的存在下,在如上文所述的C-S偶联的一般规程下,进行金属催化的C-S偶联反应,得到式A-6的硫硅烷化合物(路径-A)。然后,如PCT专利公开号WO2020257145中的文献及其中进一步引用的文献中所述,通过使用合适的碱(例如但不限于碳酸钠、碳酸钾、碳酸铯)或金属氢化物碱(例如但不限于氢化钠、氢化钾)以及氟来源((例如金属氟化物(例如但不限于氟化铯、氟化

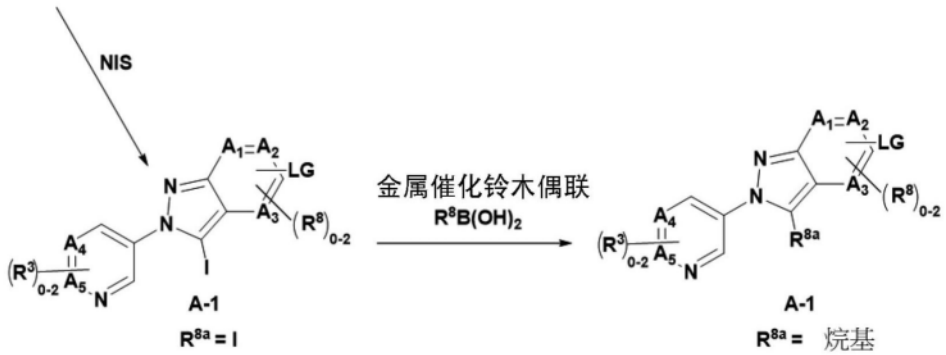
钠)或其中金属离子与四烷基铵交换的试剂(例如但不限于四甲基氟化铵、四乙基氟化铵、四丁基氟化铵)),可将式A-6的硫硅烷化合物脱保护而得到式A-7化合物。式A-7的硫醇也可以使用催化量的1,2-乙二硫醇(路径-B;例如,参见Synlett 2017;28(17)2272-2276及其中进一步引用的文献),通过式A-1化合物及商用硫化钠($Na_2S.9H_2O$)之间的金属催化偶联反应获得。式A-7的硫醇可以在合适的无机及有机碱以及合适的式R^6X的烷基卤化物存在下进一步烷基化得到式A-3化合物。式R^6X的烷基卤化物可以从市面上获得。可替代地,如PCT专利公开号WO2011087712、PCT专利公开号WO2004087156及其中进一步引用的文献所述,式A-6的硫硅烷化合物可在适当的(杂)芳基卤化物、或三氟化物、或式R^6X的甲苯磺酸盐存在下,使用适当的金属催化C-C交叉偶联反应条件,得到式A-3化合物。此外,式A-1化合物可以如上述一般规程所述,在有巯基乙酸甲酯存在的情况下进行金属催化的C-S偶联反应,得到式A-7a的硫化物(路径-C)(其中R代表烷基)。可进一步设计一碱介导的逆米歇尔反应(retro-Micheal reaction),以产生原位金属硫化物,如J.Med.Chem.2020,63,2308-2324及本文引用的文献中所述,这些金属硫化物可以与适当的烷基卤化物进行各种S-烷基化反应以获得各种A-3硫化物。除非另有说明,各变量的定义与上述定义相同。X-代表离去基,如卤素、三氟酸盐、甲磺酸盐或甲苯磺酸盐。

[0493] 流程-10:

流程10

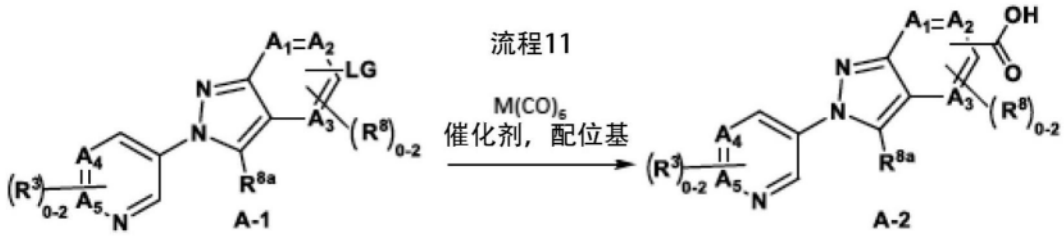


[0494]



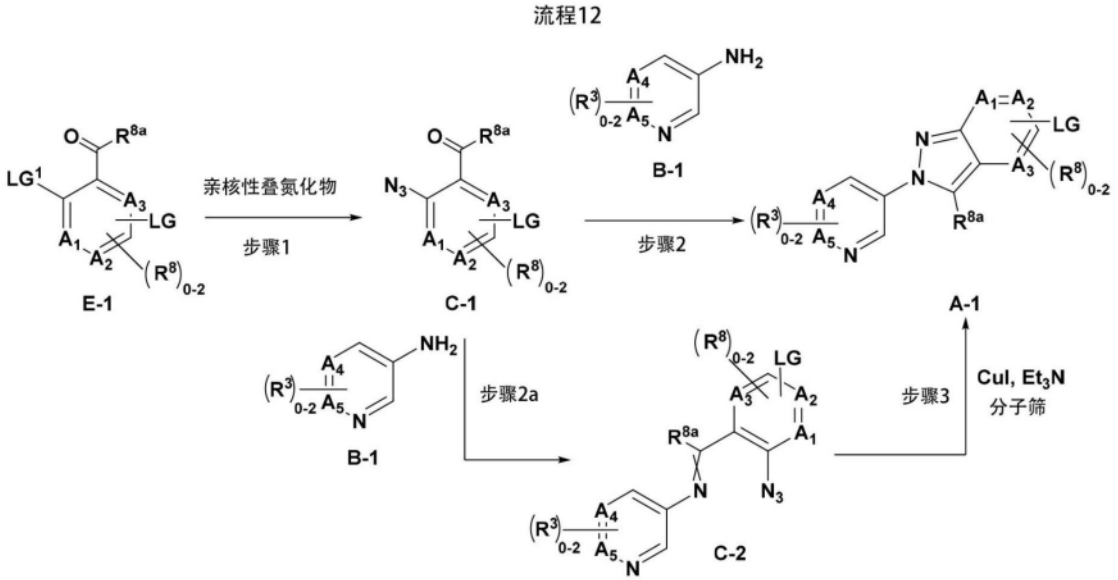
[0495] 根据流程10,本发明提供了一种在式A-1的中心吡唑环的R^8处进行选择性C-H官能化的方法,其中相同的R^8代表氢且所有其他变量具有其通常含义。在N-氯琥珀酰亚胺(N-Chlorosuccinimide,NCS)的存在下,A-1可以选择性地在中心的吡唑环上进行R^8氯化反应,形成式A-1化合物(其中吡唑-R^8代表Cl)。此外,A-1的相同的R^8氢也可以通过两个连续的步骤被烷基化。首先,在N-碘琥珀酰亚胺存在下进行类似的R^8碘化,然后在各种烷基硼酸(由式$R^8B(OH)_2$表示)存在下,进行金属催化的铃木偶联反应(Suzuki coupling reaction),形成式A-1化合物(其中吡唑-R^8代表不同的烷基(关于吲唑R^8处C-H功能化的统整概论,参见:Org.Biomol.Chem.,2022,20,7746))。

[0496] 流程-11：

[0497] 

[0498] 在根据流程11的另一实施例中,本发明提供了一种制备式A-2化合物(其中所有取代基的定义如前)的方法。式A-1化合物(其中A_1、A_2、A_3、A_4、A_5、R^3、R^8及R^{8a}具有上述定义的通常含义且LG代表离去基(较佳卤素)),可按照PCT专利公开号WO 2016144351及其中进一步引用的文献中所述的流程转化为式A-2的羧酸。在此反应中作为“CO来源”的金属六羰基选自但不限于六羰基钼以及六羰基钨。反应于一碱的存在下进行,该碱是选自但不限于金属氢化物(例如氢化钠、氢化锂以及氢化钾)、金属碳酸盐(例如碳酸钠、碳酸钾、碳酸铯)、有机胺盐(例如三乙基胺、N,N-二异丙基乙基胺、1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯(1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene);有机胺(例如、N,N-二异丙基乙基胺以及1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯(1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene))为较佳的碱。可以使用在此反应的催化剂包括,例如但不限于有机钯错合物(例如聚合物支持的双(乙酰)三苯基膦钯(II)、反式-二-μ-乙酰基双[2-(双2-甲基苯基)膦]苯甲基]二钯(trans-di-μ-acetatobis[2-[bis(2-methylphenyl)phosphino]benzyl]dipalladium)及聚合物携带的二(乙酰)二环己基膦钯(II))。用于该反应的配位基的实例选自但不限于四氟硼酸三叔丁基磷。该反应通常在0-200℃的温度范围内进行,最好是50-180℃,持续时间在30分钟到24小时之间。该反应也可以选择在微波辐射条件下进行。

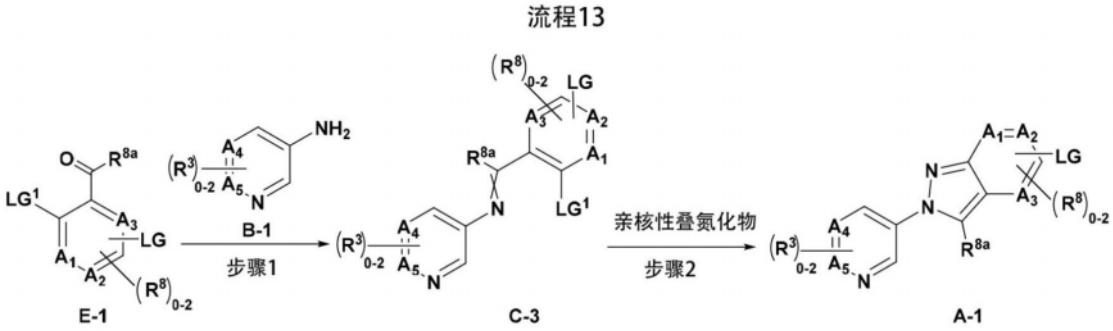
[0499] 流程-12：

[0500] 

[0501] 根据流程12,本发明提供了一种从式E-1的经取代的苯甲醛(其中A_1、A_2、A_3、R^8及R^{8a}如上定义)制备式A-1化合物的方法。LG与LG^1代表离去基,较佳为卤素取代基。式E-1的适当取代的苯甲醛可以在亲核的有机或无机迭氮化物存在下,在室温或高温下进行亲核取代反应,得到式C-1的芳基迭氮化物。具有式C-1的芳基迭氮化物可进一步与式B-1的杂芳基胺

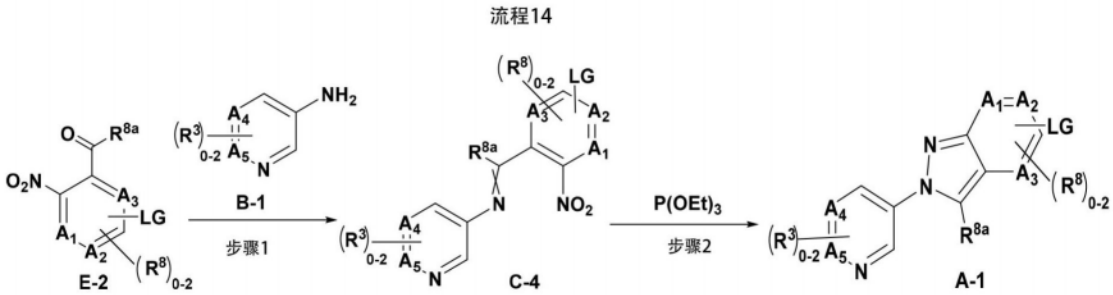
(其中A_4、A_5及R^3如上定义)反应,形成亚胺中间体,其在高温下进行原位环化而得到所需的式A-1的双环产物(例如,参见PCT专利公开号WO2016144351)。然而,根据基材的性质,这种高温原位(in situ)环化方法可能会带来额外的挑战。为规避这个问题,可实施一种较低温度的铜/配位基介导的方法来环化C-2,如文献Chem.Commun.,2011,47,10133-10135及其中引用的文献(步骤3)。

[0502] 流程-13:

[0503] 

[0504] 可替代地,式A-1化合物可依照流程13中所述的方法制备。将式E-1的经取代的苯甲醛(其中A_1、A_2、A_3、R^8及R^{8a}如上定义且LG及LG^1代表一离去基(较佳是卤素取代基))与式B-1的杂芳基胺(其中A_4、A_5及R^3如上定义),在室温或高温下反应而形成式C-3的亚胺。式C-3的亚胺在亲核的有机或无机迭氮化物存在下,在室温或高温下,可以先进行分子间取代反应,然后进行随之而来的分子内环化反应,得到式A-1的双环产物(例如,参见PCT专利公开号WO2016144351)。

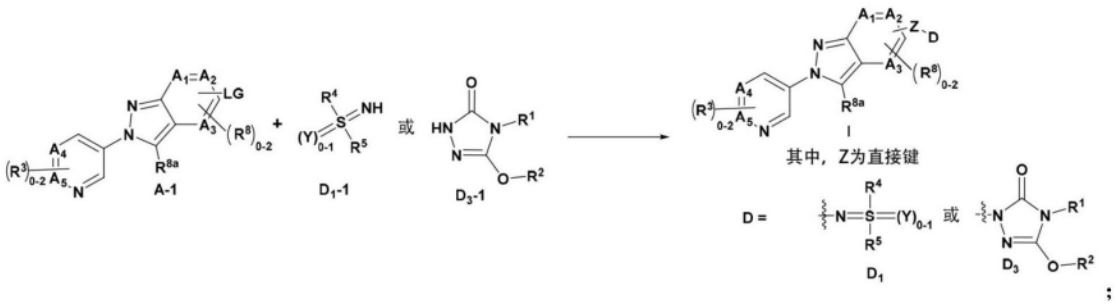
[0505] 流程-14:

[0506] 

[0507] 可替代地,式A-1化合物可依照流程14中的描述进行制备。式E-2的适当经取代的2-硝基苯甲醛(其中A_1、A_2、A3、R^8及R^{8a}如上定义)可与式B-1的杂环胺(其中A_4、A_5及R^3如上定义)反应,以形成亚胺C-4。因此,在第二反应步骤中,在合适的磷(III)试剂(例如亚磷酸三乙酯)存在下,在高温下进行还原环化,可以得到式A-1的双环化合物(例如,参见美国专利公开号US2019029788)。有几种可替代的还原环化方法可供选择,并可按Org.Lett.2014,16,3114-3117及其中引用的文献中所描述实施。

[0508] 在一实施例中,本发明提供一种其中D为D_1的式(I)化合物的制备方法,其包括步骤:

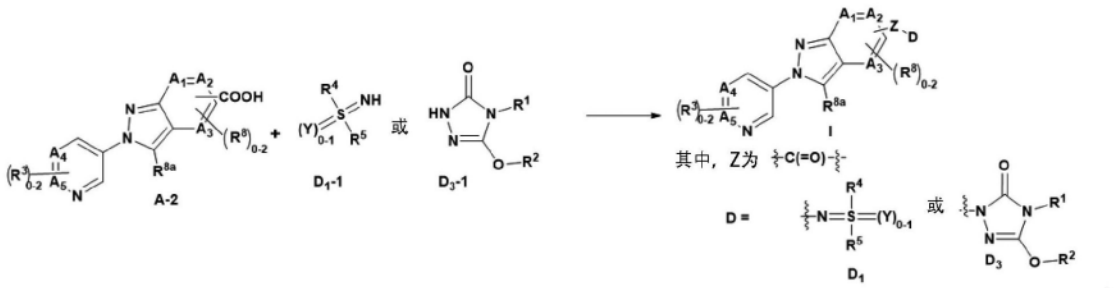
[0509] i.以一式(D_1-1)或(D_3-1)化合物与一式(A-1)化合物反应而得到其中Z为一直接键的一式(I)化合物;

[0510] 

;

[0511] 或者

[0512] i.以一式(D_1-1)或(D_3-1)化合物与一式(A-2)化合物反应而得到其中Z为一-C(=O)-键的一式(I)化合物;

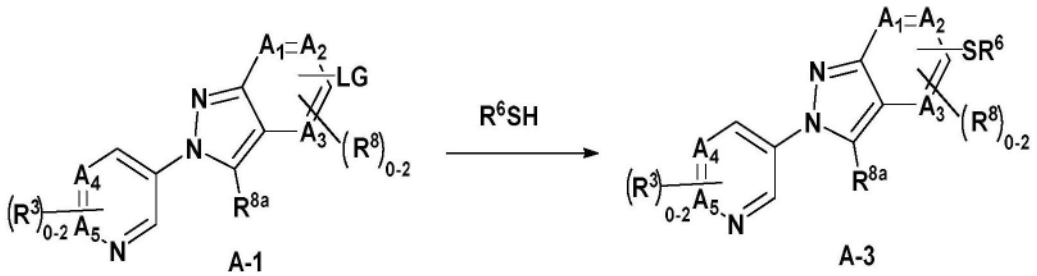
[0513] 

;

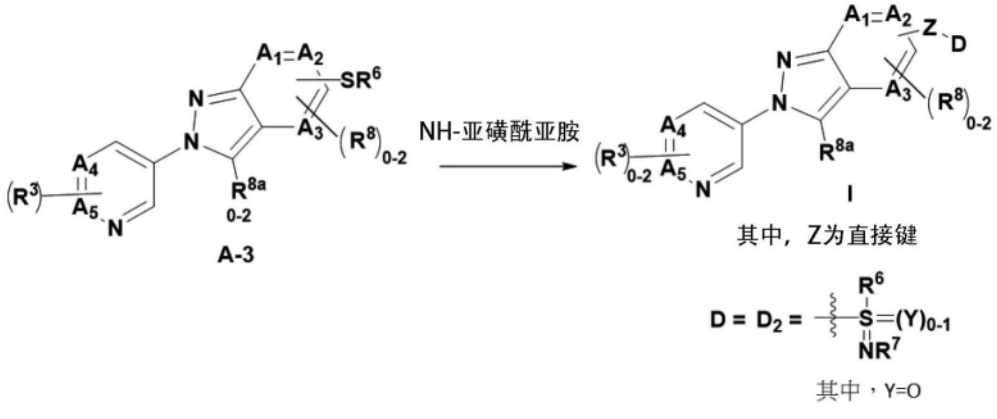
[0514] 其中,LG、A_1、A_2、A_3、A_4、A_5、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^8以及R^{8a}的定义与说明书相同。

[0515] 在另一实施例中,本发明提供一种其中D为D_2的式(I)化合物的制备方法,其包括步骤:

[0516] i.以一式R^6SH化合物与一式(A-1)化合物反应而得到其中Z为一直接键的一式(A-3)化合物;

[0517] 

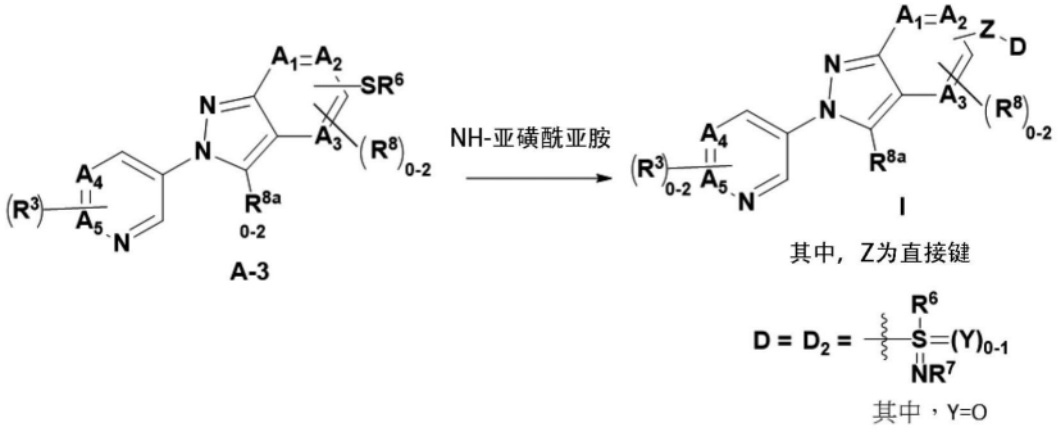
[0518] ii.利用合适的氧化剂以及氮来源通过O-以及NH-转移将该式(A-3)化合物转换为一式(I)化合物,

[0519] 

。

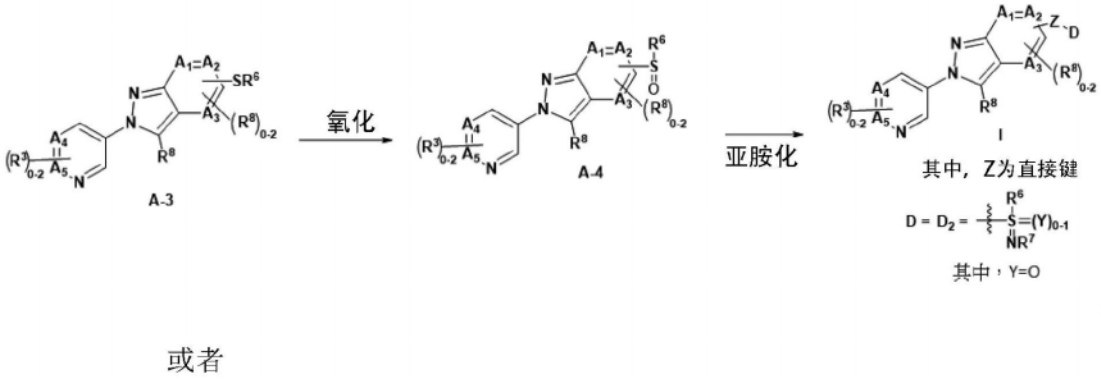
[0520] 在一实施例中,本发明提供一种其中D为D_2的式(I)化合物,且步骤ii可以如下所述的单一步骤进行:

[0521] ii.利用合适的氧化剂以及氮来源通过O-以及NH-转移将该式(A-3)化合物转换为一式(I)化合物,

[0522] 

[0523] 在一实施例中,本发明提供一种其中D为D_2的式(I)化合物,且步骤ii可以如下所述的两步骤进行:

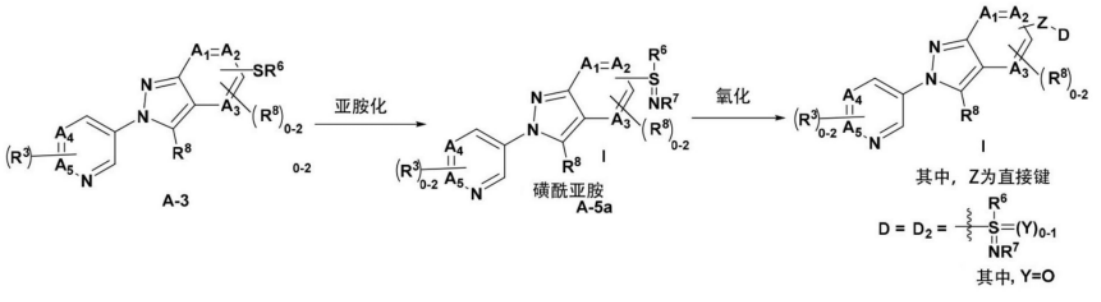
[0524] ii.利用一合适的氧化剂氧化一式(A-3)化合物而得到一式(A-4)化合物,其再进一步利用合适的氮来源或亚胺化试剂进行亚胺化而转换为式(I)化合物;

[0525] 

或者

[0526] ii.利用一合适的氮来源或亚胺化试剂对式(A-3)化合物进行亚胺化而得到式(A-5a)

[0527] 化合物,其再进一步利用一合适的氧化剂氧化而被转换为式(I)化合物;

[0528] 

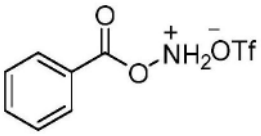
[0529] 其中,LG代表一离去基且A_1、A_2、A_3、A_4、A_5、R^3、R^6、R^7、R^8以及R^{8a}的定义是与权利要求1相同。

[0530] 步骤(ii)的合适的氧化剂是选自:H_2O_2;H_2O_2、$FeCl_3$(催化剂);H_2O_2、氧化钼酸铈

(Cerium molybdenum oxide)(催化剂);H_2O_2、三氟甲磺酸(Trifluoromethanesulfonic acid)、钨酸钠(Sodium tungsten oxide(Na_2WO_4));间氯过氧苯甲酸(m-Chloroperbenzoic acid);过碘酸钠(Sodium periodate);二乙酸碘苯(phenyliodine(III)diacetate(PIDA));盐酸或醋酸、过氧化氢;过氧乙酸(Peracetic acid);三苯甲基过氧化氢(Triphenylmethyl hydroperoxide)、催化剂:双(乙酰丙酮)二氧化钼(Bis(acetylacetonato)dioxomolybdenum);H_2O_2、四苯基溴化鏻(PB-7-23-111'1'2)-二水合伸氧基二过氧化钼1H-咪唑鎓(Tetraphenylphosphonium bromide(PB-7-23-111'1'2)-Diaquaoxodiperoxymolybdenum1H-Imidazolium)、1,3-双[(1S)-1-羧-2-甲基丙基]-(1,3-bis[(1S)-1-carboxy-2-methylpropyl]-)、内盐(inner salt);2-(1-氢过氧-1-甲基乙基)呋喃(2-(1-Hydroperoxy-1-methylethyl)furan)、催化剂:酒石酸二乙酯(Diethyl tartrate)、异丙醇钛(Titanium isopropoxide);H_2O_2、催化剂:五氯化钽(Tantalum pentachloride);过氧化叔丁醇(tert-Butyl hydroperoxide);氧气,催化剂:二氧化氮;氧气、催化剂:四氟硼酸亚硝(Nitrosonium tetrafluoroborate);次氯酸叔丁酯(tert-Butyl hypochlorite);三甲基氯硅烷(Chlorotrimethylsilane)、H_2O_2;四丁基硝酸铵(Tetrabutylammonium nitrate)、催化剂:硝酸铜、四羰基双(三苯基膦)钼盐(tetracarbonylbis(triphenylphosphine)Molybdenum);或者H_2O_2、氯化锆($ZrCl_4$)。

[0531] 步骤ii的合适的氮来源或亚胺化试剂是选自:

[0532] 胺基甲酸铵(Ammonium carbamate);迭氮化钠(Sodium azide)、碳酸氢钠;



$FeSO_4$、邻二氮菲(phenanthroline)以及MeCN(0.4mL);迭氮化钠(Sodium azide)、浓硫酸;三氟乙酰胺、MgO以及$Rh_2(OAc)_4$、$PhI(OAc)_2$;O-(均三甲苯磺酰基)羟胺(O-(mesitylsulfonyl)hydroxylamine);Ph-I=N-Ts(Ts=甲苯基磺酰基);Ph-I=N-Ns(Ns=N-烷基硝基苯亚磺酰胺);Ph-I=N-Ses(2-(三甲基硅烷基)乙磺酰基);或$Rh_2(esp)_2$以及O-(2,4-二硝基苯基)羟基胺。

[0533] 在一实施例中,该氧化剂及氮来源或亚胺化试剂可于一锅(one pot)中使用或者在分步反应中单独使用。

[0534] 在一实施例中,该氧化剂及氮来源或亚胺化试剂可以单独或合并使用。

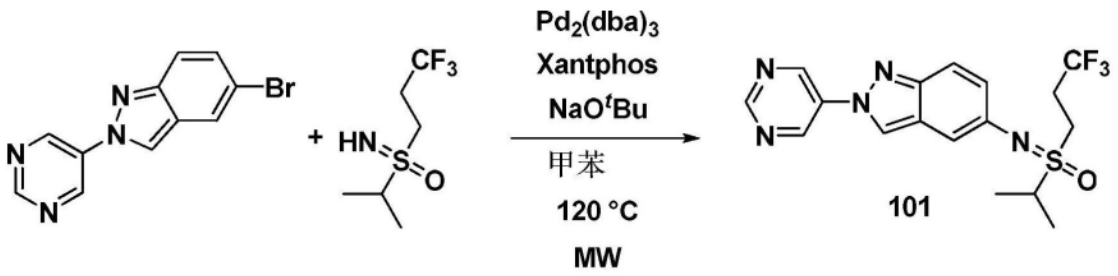
[0535] 无须进一步阐述,可合理地相信任何使用前述说明内容的所属技术领域中具有通常知识者都可以最充分地利用本发明。

[0536] 化学实例:

[0537] 以下实例阐述了制备本发明化合物的方式及方法,但不限于此,并且包括发明人为实施本发明所设想的最佳模式。

[0538] 实验流程:

[0539] 实例1:异丙基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ^6-硫烷酮(isopropyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ^6-sulfanone)101的合成

[0540] 

[0541] 5-溴-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑(5-bromo-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazole)(0.25g,0.909mmol)、亚胺基(异丙基)(3,3,3-三氟丙基)-λ^6-硫烷酮(imino(isopropyl)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ^6-sulfanone)(0.185g,0.909mmol)的甲苯(5mL)溶液,以三(二亚苯甲基丙酮)二钯(0)(tris(dibenzylideneacetone)dipalladium(0))($Pd_2(dba)_3$)(0.042g,0.045mmol)、4,5-双(二苯基膦)-9,9-二甲基氧杂蒽(9,9-dimethyl-9H-xanthene-4,5-diyl)bis(diphenylphosphane))(Xantphos)(0.053g,0.091mmol)、叔丁醇钠(NaOtBu)(0.087g,0.909mmol)处理,并于120℃在一微波装置(MW)照射1小时。反应完成后,反应混合物通过加入水(10mL)淬灭并以乙酸乙酯(2×25mL)萃取。合并的有机层以无水硫酸钠干燥并减压浓缩而得到油状剩余物。该剩余物以反相制备级高效液相层析(HPLC)纯化(梯度法:10mM醋酸铵缓冲水溶液:乙腈,自19:1至0:100)而得到所需的异丙基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ^6-硫烷酮(isopropyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ^6-sulfanone)101(209mg,0.526mmol,产率58%)。

[0542] 表1:本公开的代表性化合物依据实例1所描述的合适的起始物与方法制备。

[0543] 备注:对特定基材来说,发现以碳酸铯(Cs_2CO_3)或磷酸钾(K_3PO_4)取代叔丁醇钠时会有较好的结果。

[0544]

化合物编号	化合物名称	分析数据
1	二甲基((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dimethyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.93 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.62-7.57 (m, 2H), 7.16 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.23 (s, 6H); ESI MS (m/z): 286.95 [M+1].
2	乙基(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.92 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.62-7.56 (m, 2H), 7.17 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.37 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.12 (s, 3H), 1.29 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 300.9 [M+1].
3	二乙基((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.91 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 8.3, 4.7, 0.7 Hz, 1H), 7.56 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.17 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.34 (s, 2H), 3.29 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 314.9 [M+1].
4	1-((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (diethyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.94 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.62-7.58 (m, 2H), 7.11 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.41-3.35 (m, 2H), 3.27-3.20 (m, 2H), 2.26-2.18 (m, 2H), 2.14-2.07 (m, 2H) ESI MS (m/z): 312.9 [M+1].
5	乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.96 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.42 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.37 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.13 (s, 3H), 1.29 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 318.9 [M+1].
6	二乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.95 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.2, 2.4 Hz, 1H), 7.56 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.33 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 3.30 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 1.25 (t, J = 7.5 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 332.85 [M+1].
7	1-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (t, J = 1.4 Hz, 1H), 8.98 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.42 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.09 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.42-3.35 (m, 2H), 3.28-3.21 (m, 2H), 2.28-2.18 (m, 2H), 2.14-2.05 (m, 2H) ESI MS (m/z): 330.85 [M+1].
8	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二甲基-λ⁶-硫烷酮	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.97 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.0

[0545]

	(((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)dimethyl-λ⁶-sulfanone)	Hz, 1H), 8.42 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.57 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.14 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.22 (d, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 304.85 [M+1].
9	二甲基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((dimethyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.99 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.59 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.24 (s, 6H); ESI MS (m/z): 287.85 [M+1].
10	乙基(甲基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(methyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.98 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.17 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.38 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.13 (s, 3H), 1.29 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 301.9 [M+1].
11	二乙基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.97 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.58 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.17 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.35-3.29 (m, 4H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 315.9 [M+1].
12	1-((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.00 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.61 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.10 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.42-3.35 (m, 2H), 3.28-3.22 (m, 2H), 2.26-2.08 (m, 4H); ESI MS (m/z): 313.85 [M+1].
13	苯甲基((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 (benzyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.18 (s, 1H), 8.90 (s, 1H), 8.59 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.36 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.46-7.44 (m, 2H), 7.39-7.36 (m, 3H), 7.19 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 4.74 (d, J = 13.8 Hz, 1H), 4.66 (d, J = 14.1 Hz, 1H), 3.08 (s, 3H) ESI MS (m/z): 380[M+1].
14	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)(苯基)-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)(phenyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.13 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.88 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.61-8.60 (m, 1H), 8.35 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.98-7.95 (m, 2H), 7.67-7.58 (m, 3H), 7.52 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 6.97 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.41 (s, 3H); ESI MS (m/z): 367 [M+1].
15	(4-氟苯基)((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮 ((4-fluorophenyl)((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.13 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.88 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.35 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.93-7.84 (m, 2H), 7.53 (dt, J = 9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.48-7.42 (m, 2H), 7.08-7.04 (m, 1H), 6.97 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.70-3.59 (m, 1H), 1.33 (dd, J = 14.4, 6.6 Hz, 3H), 1.18 (dd, J = 15.2, 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 413.05 [M+1].
16	苯甲基(甲基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (benzyl(methyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.00 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.43-7.36 (m, 5H), 7.22 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 4.79 (d, J = 13.7 Hz, 1H), 4.70 (d, J = 13.7 Hz, 1H), 3.03 (s, 3H); ESI MS

[0546]

		(m/z): 364 [M+1].
17	甲基(苯基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (methyl(phenyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.41 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.90 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.97-7.95 (m, 2H), 7.67-7.58 (m, 3H), 7.54 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 6.98 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 3.42 (s, 3H); ESI MS (m/z): 350 [M+1].
18	(4-氟苯基)(异丙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((4-fluorophenyl)(isopropyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.41 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.89 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.92-7.89 (m, 2H), 7.55 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.45 (t, J = 8.8 Hz, 2H), 7.12-7.06 (m, 1H), 6.98-6.96 (m, 1H), 3.70-3.60 (m, 1H), 1.36-1.32 (m, 3H), 1.20 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 396.05 [M+1].
19	叔丁基(甲基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (tert-butyl(methyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.99 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.58 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.18 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.01 (s, 3H), 1.44 (s, 9H); ESI MS (m/z): 330 [M+1].
20	苯甲基(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (benzyl(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.94 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.63-7.58 (m, 2H), 7.43-7.35 (m, 5H), 7.22 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 4.78 (d, J = 14.1 Hz, 1H), 4.69 (d, J = 13.8 Hz, 1H), 3.02 (s, 3H); ESI MS (m/z): 363.05 [M+1].
21	甲基(苯基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (methyl(phenyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.84 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.35 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.98-7.95 (m, 2H), 7.67-7.56 (m, 4H), 7.53-7.51 (m, 1H), 7.02 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 3.41 (s, 3H); ESI MS (m/z): 349.05 [M+1].
22	(3-氟苯基)(甲基)((2-(pyridin-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((3-fluorophenyl)(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.87 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.35 (dq, J = 8.5, 1.4 Hz, 1H), 7.82-7.77 (m, 2H), 7.67 (td, J = 8.0, 5.6 Hz, 1H), 7.60-7.50 (m, 3H), 7.05-7.01 (m, 2H), 3.47 (s, 3H); ESI MS (m/z): 367.05 [M+1].
23	甲基((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(p-甲苯基)-λ⁶-硫烷酮 (methyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(p-tolyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.84 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.35 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 7.59-7.56 (m, 1H), 7.52 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.41-7.35 (m, 2H), 7.32-7.09 (m, 1H), 7.05-7.00 (m, 1H), 6.97 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.37 (s, 3H), 2.36 (d, J = 17.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 363.05 [M+1].
24	乙基(苯基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(phenyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.84 (s, 1H), 8.57 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.35 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 7.68-7.51 (m, 5H), 7.05 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.00 (s, 1H), 3.56-3.46 (m, 2H), 1.17 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 363.05 [M+1].

[0547]

25	叔丁基(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (tert-butyl(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.92 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 7.56 (dt, J = 9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.18 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.00 (s, 3H), 1.44 (s, 9H) ESI MS (m/z): 363.05 [M+1].
26	(4-氯苯基)(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((4-chlorophenyl)(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.85 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.35 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.96 (dt, J = 9.1, 2.2 Hz, 2H), 7.68 (dt, J = 9.1, 2.3 Hz, 2H), 7.60-7.52 (m, 2H), 7.03-6.98 (m, 2H), 3.44 (s, 3H); ESI MS (m/z): 382.95 [M+1].
27	甲基(戊基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (methyl(pentyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.92 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.57 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.34 (dd, J = 9.9, 6.0 Hz, 2H), 3.13 (s, 3H), 1.80-1.72 (m, 2H), 1.39-1.24 (m, 4H), 0.85 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 342.6 [M+1].
28	二异丙基((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diisopropyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26-9.20 (m, 1H), 8.89 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.59 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 7.54-7.52 (m, 1H), 7.20 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.09 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.66-3.55 (m, 2H), 1.34 (d, J = 6.6 Hz, 6H), 1.27 (d, J = 6.8 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 342.55 [M+1].
29	乙基(异丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(isopropyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.90 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J = 8.4, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.57-7.54 (m, 1H), 7.18 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.57-3.50 (m, 1H), 3.27 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 1.37 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.30 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.24 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 328.55 [M+1].
30	甲基(吡啶-3-基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (methyl(pyridin-3-yl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.09 (dd, J = 2.3, 0.6 Hz, 1H), 8.87 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.80 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.34 (tdd, J = 8.1, 2.5, 1.6 Hz, 2H), 7.64 (ddd, J = 8.1, 4.8, 0.9 Hz, 1H), 7.60-7.53 (m, 2H), 7.05-7.02 (m, 2H), 3.53 (s, 3H) ESI MS (m/z): 349.6 [M+1].
31	二异丙基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diisopropyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.46 (s, 2H), 9.20 (s, 1H), 8.95 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.56-7.54 (m, 1H), 7.56-7.10 (m, 2H), 7.20 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.11 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.65-3.58 (m, 2H), 1.30 (dd, J = 27.0, 6.7 Hz, 12H); ESI MS (m/z): 343.65 [M+1].
32	乙基(异丙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(isopropyl)((2-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 8.97 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.59-7.56 (m, 1H), 7.18 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.05 (dd, J =

[0548]

	(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.58-3.51 (m, 1H), 3.28 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 1.37 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.30 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.24 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 329.6 [M+1].
33	甲基(戊基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (methyl(pentyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.99 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.59 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.36 (dd, J = 10.0, 6.1 Hz, 2H), 3.15 (s, 3H), 1.80-1.72 (m, 2H), 1.38-1.26 (m, 4H), 0.84 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 343.6 [M+1].
34	乙基(苯基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (ethyl(phenyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.40 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.90 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.92-7.89 (m, 2H), 7.69-7.59 (m, 3H), 7.55 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.07 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.57-3.47 (m, 2H), 1.17 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 363.6 [M+1].
35	甲基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(p-甲苯基)-λ^6-硫烷酮 (methyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(p-tolyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.41 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.90 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.55-7.52 (m, 1H), 7.40 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.03 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.96 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.38 (s, 3H), 2.34 (s, 3H); ESI MS (m/z): 363.6 [M+1].
36	(3-氟苯基)(甲基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 ((3-fluorophenyl)(methyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.41 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.93 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.82-7.77 (m, 2H), 7.69-7.64 (m, 1H), 7.57-7.52 (m, 2H), 7.06-7.00 (m, 2H), 3.48 (s, 3H) ESI MS (m/z): 367.6 [M+1].
37	(4-氯苯基)(甲基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 ((4-chlorophenyl)(methyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.41 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.92 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.96 (dt, J = 9.1, 2.3 Hz, 2H), 7.69 (dt, J = 9.1, 2.3 Hz, 2H), 7.57-7.54 (m, 1H), 7.03 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.98 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.45 (s, 3H); ESI MS (m/z): 383.7 [M+1].
38	(4-氟苯基)(异丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 ((4-fluorophenyl)(isopropyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.84 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.35 (dq, J = 8.5, 1.3 Hz, 1H), 7.93-7.88 (m, 2H), 7.57 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 7.54-7.52 (m, 1H), 7.48-7.42 (m, 2H), 7.06 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.67-3.60 (m, 1H), 1.35 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.19 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 395.25 [M+1].
39	甲基(吡啶-3-基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (methyl(pyridin-3-yl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.43 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.10 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.94 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.82 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.35 (dt, J = 8.1, 2.0 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 7.7, 4.5 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.09-7.05 (m, 2H), 3.55 (s, 3H); ESI MS (m/z): 351.05 [M+1].
40	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)(吡啶-3-基)-λ^6-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.13 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 9.09 (dd, J = 2.4, 0.7 Hz, 1H), 8.90 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.80 (dd, J = 4.8, 1.6 Hz, 1H), 8.61 (d, J

[0549]

	硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)(pyridin-3-yl)-λ⁶-sulfanone)	= 2.4 Hz, 1H), 8.37-8.32 (m, 2H), 7.64 (ddd, J = 8.1, 4.8, 0.9 Hz, 1H), 7.56-7.53 (m, 1H), 7.06-7.01 (m, 2H), 3.53 (s, 3H); ESI MS (m/z): 368.10 [M+1].
41	乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (s, 1H), 8.95 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.54 (td, J = 13.7, 6.8 Hz, 1H), 3.28 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 1.37 (dd, J = 15.2, 8.3 Hz, 3H), 1.32-1.28 (m, 3H), 1.26-1.19 (m, 3H); ESI MS (m/z): 347.10 [M+1].
42	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)(戊基)-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)(pentyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.96 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.9 Hz, 1H), 8.42 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.57 (dt, J = 9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.14 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.35 (dd, J = 9.8, 6.1 Hz, 2H), 3.14 (s, 3H), 1.80-1.72 (m, 2H), 1.38-1.26 (m, 4H), 0.84 (t, J = 7.1 Hz, 3H);ESI MS (m/z): 361.10 [M+1].
43	二甲基((2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.99 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.36 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.11 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.26 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.14 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.35 (d, J = 7.3 Hz, 3H), 3.30 (s, 1H), 1.25 (q, J = 7.5 Hz, 6H);ESI MS (m/z): 316.05 [M+1].
44	苯甲基(甲基)((2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (benzyl(methyl)((2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.00 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.36 (dd, J = 5.7, 0.9 Hz, 1H), 9.13 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.27 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.43-7.36 (m, 5H), 7.18 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 4.80 (d, J = 13.7 Hz, 1H), 4.72 (d, J = 13.7 Hz, 1H), 3.04 (s, 3H); ESI MS (m/z): 364.10 [M+1].
45	甲基(苯基)((2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (methyl(phenyl)((2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.92 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.33 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.04 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.20 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.96 (dt, J = 6.6, 1.7 Hz, 2H), 7.68-7.59 (m, 3H), 7.54 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.94 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.43 (s, 3H); ESI MS (m/z): 350.15 [M+1].
46	(4-氟苯基)(异丙基)((2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((4-fluorophenyl)(isopropyl)((2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.92 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.33 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.20 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.92-7.87 (m, 2H), 7.55 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.48-7.41 (m, 2H), 7.10 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 6.94 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.69-3.63 (m, 1H), 1.36-1.32 (m, 3H), 1.21-1.17 (m, 3H); ESI MS (m/z): 396.20 [M+1].
47	甲基(戊基)((2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (methyl(pentyl)((2-(pyridazin-4-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.99 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.36 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.11 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.27 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.60-7.57 (m,

[0550]

	yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H), 7.13 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.37 (dd, J = 10.1, 5.7 Hz, 2H), 3.16 (s, 3H), 1.79-1.72 (m, 2H), 1.38-1.26 (m, 4H), 0.84 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 344.20 [M+1].
48	乙基(异丙基)((2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(isopropyl)((2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.99 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.36 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.10 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.26 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.15 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.07 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.59-3.52 (m, 1H), 3.33-3.29 (m, 2H), 1.37 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.30 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.24 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 330.20 [M+1].
49	甲基((2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(吡啶-3-基)-λ⁶-硫烷酮 (methyl((2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(pyridin-3-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.93 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.34 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.09 (dd, J = 2.3, 0.6 Hz, 1H), 9.06 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.81 (dd, J = 4.8, 1.6 Hz, 1H), 8.34 (ddd, J = 8.1, 2.3, 1.6 Hz, 1H), 8.21 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.65 (ddd, J = 8.1, 4.9, 0.7 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.07 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.54 (s, 3H); ESI MS (m/z): 351.10 [M+1].
50	(4-氯苯基)(甲基)((2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((4-chlorophenyl)(methyl)((2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.93 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.34 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.05 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.21 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.96 (dt, J = 9.0, 2.3 Hz, 2H), 7.69 (dt, J = 9.0, 2.3 Hz, 2H), 7.55 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.94 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.46 (s, 3H) ESI MS (m/z): 384.15 [M+1].
51	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)(p-甲苯基)-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)(p-tolyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.13 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.88 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.35 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.83 (dd, J = 6.6, 1.7 Hz, 2H), 7.52 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.03 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 6.95 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 3.38 (s, 3H), 2.34 (s, 3H); ESI MS (m/z): 380.9 [M+1].
52	甲基((2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(p-甲苯基)-λ⁶-硫烷酮 (methyl((2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(p-tolyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.93 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.33 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.20 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.54 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 7.8 Hz, 2H), 7.05 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.92 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.39 (s, 3H), 2.34 (s, 3H) ESI MS (m/z): 364.3 [M+1].
53	乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(苯基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(phenyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.12 (s, 1H), 8.88 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.35 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.92-7.89 (m, 2H), 7.68-7.59 (m, 3H), 7.53 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 6.97 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.56-3.47 (m, 2H), 1.19-1.15 (m, 3H); ESI MS (m/z): 380.9 [M+1].
54	乙基(甲基)((2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(methyl)((2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.00 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.36 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.11 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.27 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.14 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.39 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 3.14 (s, 3H),

[0551]

	sulfanone)	1.29 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 301.9 [M+1].
55	(4-氯苯基)((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)-λ^6-硫烷酮 ((4-chlorophenyl)((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.13 (s, 1H), 8.90 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.36 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.96 (dt, J = 9.0, 2.3 Hz, 2H), 7.69 (dt, J = 9.1, 2.2 Hz, 2H), 7.54 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 9.2, 2.0 Hz, 1H), 6.96 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.45 (s, 3H); ESI MS (m/z): 400.9 [M+1].
56	1-((2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ^6-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ^6-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.85 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.30 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.03-8.00 (m, 1H), 7.63 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.14 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.53-3.46 (m, 2H), 3.26-3.19 (m, 2H), 2.39-2.29 (m, 5H), 1.33-1.25 (m, 3H); ESI MS (m/z): 313.9 [M+1].
57	(3-氟苯基)(甲基)((2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 ((3-fluorophenyl)(methyl)((2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.78 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.26 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 8.29 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.93 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.78 (dq, J = 7.8, 0.9 Hz, 1H), 7.72-7.69 (m, 1H), 7.59-7.50 (m, 2H), 7.29 (tdd, J = 8.3, 2.5, 0.9 Hz, 1H), 7.16 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.12 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.30 (s, 3H); ESI MS (m/z): 368 [M+1].
58	(3-氟苯基)((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)-λ^6-硫烷酮 ((3-fluorophenyl)((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.92-8.19 (m, 2H), 8.91 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.46 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.20 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.02 (dt, J = 9.4, 2.4 Hz, 1H), 7.79 (dq, J = 7.8, 0.9 Hz, 1H), 7.72 (dt, J = 7.8, 2.1 Hz, 1H), 7.59 (dt, J = 9.0, 1.0 Hz, 1H), 7.52 (td, J = 8.1, 5.1 Hz, 1H), 7.31-7.27 (m, 1H), 7.17-7.14 (m, 2H), 3.30 (s, 3H); ESI MS (m/z): 384.9 [M+1].
59	苯基((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ^6-硫烷酮 (phenyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.09 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.21-8.18 (m, 2H), 7.98-7.96 (m, 2H), 7.66-7.55 (m, 4H), 7.46-7.42 (m, 1H), 7.18-7.14 (m, 2H), 3.61-3.55 (m, 1H), 3.49-3.41 (m, 1H), 2.78-2.64 (m, 2H); ESI MS (m/z): 431 [M+1].
60	(4-甲氧基苯基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ^6-硫烷酮 ((4-methoxyphenyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.09 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.19 (ddd, J = 8.6, 2.9, 1.3 Hz, 2H), 8.00 (dd, J = 7.8, 1.7 Hz, 1H), 7.57-7.52 (m, 2H), 7.43 (ddd, J = 8.3, 4.9, 0.7 Hz, 1H), 7.15 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.09-7.05 (m, 2H), 7.01-6.99 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.89-3.72 (m, 2H), 2.86-2.75 (m, 1H), 2.62-2.51 (m, 1H) ESI MS (m/z): 461 [M+1].
61	(4-氟苯基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ^6-硫烷酮 ((4-fluorophenyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.88 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.59 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.36 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.06-8.02 (m, 2H), 7.60-7.55 (m, 2H), 7.50-7.44 (m, 2H), 7.08-7.04 (m, 2H), 3.90-3.76 (m, 2H), 2.82-2.72 (m, 2H); ESI MS (m/z): 449 [M+1].
62	苯基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ^6-硫烷酮 (phenyl((2-(pyrimidin-5-	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.25 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.18 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.98-7.95 (m, 2H), 7.67-7.55 (m, 4H), 7.19-7.15 (m, 2H), 3.63-

[0552]

	yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	3.41 (m, 2H), 2.83-2.61 (m, 2H); ESI MS (m/z): 432 [M+1].
63	(4-甲氧基苯基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷酮 ((4-methoxyphenyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.25 (s, 2H), 9.19 (s, 1H), 8.17 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.57-7.52 (m, 2H), 7.13-7.06 (m, 3H), 7.01-6.99 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.89-3.71 (m, 2H), 2.82-2.77 (m, 1H), 2.61-2.55 (m, 1H); ESI MS (m/z): 462.2 [M+1].
64	(4-氟苯基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷酮 ((4-fluorophenyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.42 (s, 2H), 9.20 (s, 1H), 8.94 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.04 (dd, J = 8.9, 5.3 Hz, 2H), 7.58 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.47 (t, J = 8.9 Hz, 2H), 7.09 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.88-3.81 (m, 2H), 2.81-2.73 (m, 2H); ESI MS (m/z): 450 [M+1].
65	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(苯基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(phenyl)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.91 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.46 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.18 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.03-7.95 (m, 3H), 7.66-7.55 (m, 4H), 7.16 (dd, J = 8.8, 2.0 Hz, 2H), 3.62-3.41 (m, 2H), 2.82-2.60 (m, 2H); ESI MS (m/z): 449 [M+1].
66	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(4-甲氧基苯基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(4-methoxyphenyl)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.91 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.46 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.18 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.03-7.99 (m, 2H), 7.57-7.52 (m, 2H), 7.12 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.09-7.05 (m, 2H), 7.00 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.95 (d, J = 10.5 Hz, 3H), 3.89-3.71 (m, 2H), 2.82-2.52 (m, 2H); ESI MS (m/z): 478.9 [M+1].
67	(4-氟苯基)((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷酮 ((4-fluorophenyl)((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.91 (t, J = 0.8 Hz, 1H), 8.47 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.19 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.04-7.95 (m, 3H), 7.61-7.59 (m, 1H), 7.26-7.21 (m, 2H), 7.15-7.12 (m, 2H), 3.63-3.55 (m, 1H), 3.48-3.40 (m, 1H), 2.83-2.61 (m, 2H) ESI MS (m/z): 466.9 [M+1].
68	苯基((2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷酮 (phenyl((2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.77 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.26 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.98-7.92 (m, 3H), 7.67-7.63 (m, 1H), 7.60-7.56 (m, 3H), 7.17 (dd, J = 9.3, 2.2 Hz, 1H), 7.10 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.63-3.41 (m, 2H), 2.83-2.60 (m, 2H); ESI MS (m/z): 432.2 [M+1].
69	(4-甲氧基苯基)((2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷酮 ((4-methoxyphenyl)((2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.78 (q, J = 1.3 Hz, 1H), 9.26 (dd, J = 5.6, 1.0 Hz, 1H), 8.29 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.00-7.93 (m, 3H), 7.59 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.25-7.22 (m, 2H), 7.15 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.09 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 3.63-3.40 (m, 2H), 2.84-2.61 (m, 2H); ESI MS (m/z): 462.3 [M+1].
70	(4-氟苯基)((2-(哒嗪-4-基)-2H-吲	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.78 (q, J = 1.3 Hz, 1H), 9.26 (dd, J = 5.6, 1.0 Hz, 1H), 8.29

[0553]

	唑-5-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷酮 ((4-fluorophenyl)((2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	(d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.00-7.93 (m, 3H), 7.59 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.25-7.22 (m, 2H), 7.15 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.09 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 3.63-3.40 (m, 2H), 2.84-2.61 (m, 2H); ESI MS(m/z): 450.3 [M+1].
71	乙基(异丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(isopropyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.02 (s, 1H), 8.61 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.51-8.48 (m, 1H), 7.61-7.58 (m, 1H), 7.17-7.08 (m, 2H), 6.61 (d, J = 6.4 Hz, 1H), 3.64-3.57 (m, 1H), 3.40-3.34 (m, 2H), 1.44 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.36 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 329.3 [M+1].
72	二甲基((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dimethyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.99 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.50-8.47 (m, 1H), 7.61-7.58 (m, 1H), 7.20-7.12 (m, 2H), 6.58 (dd, J = 6.8, 0.7 Hz, 1H), 3.32 (s, 6H); ESI MS (m/z): 287.1 [M+1].
73	二乙基((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 9.01 (s, 1H), 8.60 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.51-8.48 (m, 1H), 7.61-7.58 (m, 1H), 7.18-7.10 (m, 2H), 6.59 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 3.39 (q, J = 7.4 Hz, 4H), 1.30 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 315.15 [M+1].
74	异丙基(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (isopropyl(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.19 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.63 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.59 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.30-8.27 (m, 1H), 7.48-7.45 (m, 1H), 7.37 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 8.8, 7.1 Hz, 1H), 6.79-6.77 (m, 1H), 3.55-3.48 (m, 1H), 3.02 (s, 3H), 1.58 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.54 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 315.3 [M+1].
75	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)二异丁基-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)diisobutyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.01 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.56 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.48 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.10 (dt, J = 9.3, 2.3 Hz, 1H), 7.32-7.29 (m, 1H), 7.20 (dd, J = 8.8, 7.1 Hz, 1H), 6.74 (dd, J = 7.3, 0.5 Hz, 1H), 3.25 (dd, J = 14.2, 6.1 Hz, 2H), 3.08 (td, J = 13.8, 6.6 Hz, 2H), 2.49-2.39 (m, 2H), 1.16-1.11 (m, 12H); ESI MS (m/z): 389.4 [M+1].
76	二丙基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dipropyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.35 (s, 2H), 9.22 (s, 1H), 8.59 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.35 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 8.8, 7.1 Hz, 1H), 6.76 (dd, J = 7.1, 0.5 Hz, 1H), 3.30-3.16 (m, 4H), 1.97-1.88 (m, 4H), 1.07 (q, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 344.3 [M+1].
77	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)二丙基-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)dipropyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.02 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.59 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.11 (dt, J = 9.3, 2.3 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.20 (dd, J = 8.8, 7.1 Hz, 1H), 6.76-6.74 (m, 1H), 3.30-3.16 (m, 4H), 2.96 (s, 1H), 2.88 (d, J = 0.5 Hz, 1H), 1.98-1.88 (m, 4H), 1.08 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 361 [M+1].
78	二丙基((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.7

[0554]

	4-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dipropyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	Hz, 1H), 8.98 (s, 1H), 8.61 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.50-8.47 (m, 1H), 7.60 (dd, J = 8.1, 4.6 Hz, 1H), 7.17-7.09 (m, 2H), 6.58 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 3.42-3.33 (m, 4H), 1.81 (dt, J = 23.6, 7.4 Hz, 4H), 0.98 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 343.3 [M+1].
79	二异丁基((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diisobutyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.92 (s, 1H), 8.60 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 8.41 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.62-7.55 (m, 4H), 7.16 (s, 1H), 6.98 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.24-3.17 (m, 4H), 2.29 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 1.09-1.01 (m, 12H); ESI MS (m/z): 371.1 [M+1].
80	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二异丁基-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)diisobutyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (s, 1H), 8.97 (s, 1H), 8.63 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.27-3.18 (m, 4H), 2.32-2.24 (m, 2H), 1.09-1.01 (m, 12H); ESI MS (m/z): 389.2 [M+1].
81	1-((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.13 (s, 1H), 7.22-7.16 (m, 2H), 6.52 (dd, J = 6.4, 1.2 Hz, 1H), 3.48-3.33 (m, 4H), 2.32-2.10 (m, 4H); ESI MS (m/z): 314 [M+1].
82	二甲基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dimethyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.53 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.09 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.19-7.15 (m, 2H), 6.60 (dd, J = 6.5, 1.3 Hz, 1H), 3.33 (s, 6H); ESI MS (m/z): 287.9 [M+1].
83	二乙基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.11 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.19-7.12 (m, 2H), 6.61 (dd, J = 6.6, 1.0 Hz, 1H), 3.40 (q, J = 7.4 Hz, 4H), 1.31 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 316.1 [M+1].
84	异丙基(甲基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (isopropyl(methyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (d, J = 3.7 Hz, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.11 (d, J = 0.5 Hz, 1H), 7.19-7.13 (m, 2H), 6.62 (dd, J = 6.1, 1.5 Hz, 1H), 3.63-3.56 (m, 1H), 3.15 (s, 3H), 1.48 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.42 (d, J = 6.8 Hz, 3H);ESI MS (m/z): 315.9 [M+1].
85	乙基(异丙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(isopropyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.12 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.18-7.11 (m, 2H), 6.62 (dd, J = 6.5, 1.3 Hz, 1H), 3.65-3.58 (m, 1H), 3.41-3.34 (m, 2H), 1.45 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.36 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.28 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 330[M+1].
86	1-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 9.10 (d, J = 0.5 Hz, 1H), 8.63-8.63 (m, 1H), 8.53 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.20-7.15 (m, 2H), 6.51 (dd, J = 6.0, 1.8 Hz, 1H), 3.47-3.34 (m, 4H), 2.31-2.10 (m, 4H); ESI MS (m/z): 331[M+1].
87	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25 (t, J = 1.3

[0555]

	基)亚胺基)二甲基-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)dimethyl-λ⁶-sulfanone)	Hz, 1H), 9.06 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63-8.63 (m, 1H), 8.52 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.20-7.14 (m, 2H), 6.59 (dd, J = 6.2, 1.6 Hz, 1H), 3.32 (s, 6H); ESI MS (m/z): 305[M+1].
88	1-((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J = 8.4, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.21-7.13 (m, 2H), 6.51 (dd, J = 6.7, 0.9 Hz, 1H), 3.47-3.41 (m, 2H), 3.36-3.33 (m, 2H), 2.29-2.21 (m, 2H), 2.20-2.14 (m, 2H), 1.90 (s, 1H), 1.22 (s, 1H); ESI MS (m/z): 389.2 [M+1].
89	二乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 9.08 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63-8.63 (m, 1H), 8.53 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.17-7.11 (m, 2H), 6.59 (dd, J = 6.5, 1.3 Hz, 1H), 3.39 (q, J = 7.4 Hz, 4H), 1.31 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 333 [M+1].
90	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)(异丙基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)(isopropyl)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (t, J = 1.3 Hz, 1H), 9.08 (s, 1H), 8.64-8.63 (m, 1H), 8.54 (dt, J = 10.1, 2.4 Hz, 1H), 7.17-7.12 (m, 2H), 6.61 (dd, J = 5.7, 2.1 Hz, 1H), 3.62-3.55 (m, 1H), 3.14 (s, 3H), 1.48 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.42 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 333 [M+1].
91	乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 9.09 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63-8.63 (m, 1H), 8.54 (dt, J = 10.1, 2.4 Hz, 1H), 7.16-7.10 (m, 2H), 6.61 (dd, J = 6.2, 1.6 Hz, 1H), 3.64-3.58 (m, 1H), 3.41-3.35 (m, 2H), 1.45 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.36 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.28 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 347.2 [M+1].
99	异丙基((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷酮 (isopropyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.94 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.62-7.58 (m, 2H), 7.21 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.70-3.63 (m, 1H), 3.52-3.48 (m, 2H), 2.85-2.73 (m, 2H), 1.40 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.34 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 397 [M+1].
100	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(异丙基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(isopropyl)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (s, 1H), 8.99 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.43 (dt, J = 10.1, 2.4 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.20 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.71-3.61 (m, 1H), 3.53-3.49 (m, 2H), 2.85-2.72 (m, 2H), 1.40 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.34 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 415 [M+1].
101	异丙基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷酮 (isopropyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.22 (s, 1H), 9.00 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.22 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.71-3.64 (m, 1H), 3.53-3.49 (m, 2H), 2.85-2.73 (m, 2H), 1.40 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.34 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 398 [M+1].

[0556]

102	异丙基((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷酮 (isopropyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.34 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.07 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.62 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 8.3, 4.7, 0.7 Hz, 1H), 7.21 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.13 (dd, J = 8.6, 7.0 Hz, 1H), 6.63-6.61 (m, 1H), 3.78-3.71 (m, 1H), 3.58 (q, J = 5.2 Hz, 2H), 2.92-2.79 (m, 2H), 1.47 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.39 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 397 [M+1].
103	异丙基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷酮 (isopropyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (d, J = 3.1 Hz, 2H), 9.23 (s, 1H), 9.16 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 7.9, 0.9 Hz, 1H), 7.15 (dd, J = 8.7, 6.9 Hz, 1H), 6.64 (dd, J = 7.0, 0.6 Hz, 1H), 3.79-3.72 (m, 1H), 3.61-3.57 (m, 2H), 2.91-2.79 (m, 2H), 1.48 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.39 (d, J = 6.7 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 398 [M+1].
104	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)(异丙基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)(isopropyl)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (s, 1H), 9.13 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.53 (dt, J = 10.2, 2.4 Hz, 1H), 7.20 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.14 (dd, J = 8.7, 6.9 Hz, 1H), 6.62 (dd, J = 6.9, 0.8 Hz, 1H), 3.78-3.71 (m, 1H), 3.61-3.57 (m, 2H), 2.91-2.79 (m, 2H), 1.48 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.39 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS (m/z):415 [M+1].
108	乙基((7-氟-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl((7-fluoro-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.35 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.12 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.52 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.62 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 11.7, 7.8 Hz, 1H), 6.48 (dd, J = 7.9, 3.3 Hz, 1H), 3.62-3.55 (m, 1H), 2.97-2.87 (m, 1H), 1.43 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.35 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.22-1.17 (m, 4H); ESI MS (m/z):347[M+1].
109	乙基((7-氟-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl((7-fluoro-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.11 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.64 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.62 (ddd, J = 8.4, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 6.93 (dd, J = 11.9, 7.9 Hz, 1H), 6.46 (dd, J = 7.9, 3.3 Hz, 1H), 3.42 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.19 (s, 3H), 1.35 (t, J = 7.3 Hz, 3H) ESI MS (m/z):319 [M+1].
136	乙基(丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)- λ⁶-硫烷酮 (ethyl(propyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)- λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.99 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.61 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 7.17 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.11 (dd, J = 8.7, 7.0 Hz, 1H), 6.59 (dd, J = 6.8, 1.0 Hz, 1H), 3.42-3.33 (m, 4H), 1.81 (dt, J = 23.6, 7.4 Hz, 2H), 1.34-1.29 (m, 4H), 1.26-1.22 (m, 3H), 0.99 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 0.84 (t, J = 6.7 Hz, 1H); ESI MS(m/z): 328.55 [M+1].
137	乙基(丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(propyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.91 (s, 1H), 8.60 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.62-7.55 (m, 2H), 7.17 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.33 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 3.29-3.25 (m, 3H), 1.75 (q, J = 7.8 Hz, 2H), 1.28-1.15 (m, 5H), 0.97 (t, J

[0557]

		= 7.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z): 328.95 [M+1].
138	乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)(丙基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)(propyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (s, 1H), 9.07 (d, J = 0.5 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.17-7.11 (m, 2H), 6.59 (dd, J = 6.2, 1.6 Hz, 1H), 3.43-3.34 (m, 4H), 1.81 (dt, J = 23.5, 7.3 Hz, 2H), 1.31 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z): 346.55 [M+1].
139	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)二丙基-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)dipropyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (s, 1H), 9.00 (s, 1H), 8.67 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.46 (dt, J = 10.1, 2.4 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.37-3.33 (m, 4H), 1.77 (dt, J = 23.8, 7.3 Hz, 4H), 0.97 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS (m/z):361.55 [M+1].
140	(3-氟吡啶-2-基)((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 ((3-fluoropyridin-2-yl)((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 9.00 (s, 1H), 8.66 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.58 (td, J = 3.0, 1.4 Hz, 1H), 8.43 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.03-7.98 (m, 1H), 7.81-7.77 (m, 1H), 7.49 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.66 (s, 3H); ESI MS (m/z):386.4 [M+1].
141	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)(甲基)(吡啶-3-基)-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)(methyl)(pyridin-3-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.15-9.13 (m, 2H), 8.94 (s, 1H), 8.83 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.42-8.36 (m, 3H), 7.66 (ddd, J = 8.2, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.61 (s, 3H); ESI MS(m/z):368.45 [M+1].
142	(2-氯吡啶-3-基)((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 ((2-chloropyridin-3-yl)((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.14 (s, 1H), 8.94 (s, 1H), 8.65 (td, J = 4.7, 2.0 Hz, 2H), 8.60 (dd, J = 7.8, 2.0 Hz, 1H), 8.42-8.39 (m, 2H), 7.71 (dd, J = 7.8, 4.6 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.71 (s, 3H); ESI MS(m/z):402.4 [M+1].
143	(5-氟吡啶-3-基)((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 ((5-fluoropyridin-3-yl)((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.16 (s, 1H), 8.95 (s, 1H), 8.85-8.81 (m, 1H), 8.68-8.66 (m, 1H), 8.42 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.29 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 8.03 (td, J = 8.6, 2.9 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.56 (s, 3H); ESI MS(m/z):386.45 [M+1].
144	(5-氯吡啶-3-基)((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 ((5-chloropyridin-3-yl)((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.16 (s, 1H), 8.95 (s, 1H), 8.85-8.81 (m, 1H), 8.68-8.66 (m, 1H), 8.42 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.29 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 8.03 (td, J = 8.6, 2.9 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.56 (s, 3H); ESI MS(m/z):402.45 [M+1].
145	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.0

[0558]

	[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)(甲基)(6-(三氟甲基)吡啶-3-基)-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)(methyl)(6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl)-λ⁶-sulfanone)	Hz, 1H), 9.15 (s, 1H), 8.96 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 6.8, 2.4 Hz, 2H), 8.44-8.39 (m, 2H), 8.18 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.69 (s, 3H); ESI MS(m/z):437.05 [M+1].
146	二甲基((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dimethyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.29 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.98 (s, 1H), 8.64 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.45 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.65-7.62 (m, 1H), 7.57 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.29 (s, 6H); ESI MS(m/z):287.5 [M+1].
147	乙基(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.29 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.97 (s, 1H), 8.64 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.65-7.62 (m, 1H), 7.57 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.48-3.41 (m, 2H), 3.20 (s, 3H), 1.31 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):301.5 [M+1].
148	乙基(异丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(isopropyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.96 (s, 1H), 8.64 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.43 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.34 (dd, J = 11.7, 2.7 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.59-7.57 (m, 1H), 3.66-3.56 (m, 1H), 3.40-3.33 (m, 2H), 1.39 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.32 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.25 (q, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS(m/z):329.55 [M+1].
149	二丙基((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dipropyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.96 (s, 1H), 8.64 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 8.1, 4.4 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.34 (dd, J = 9.7, 6.0 Hz, 4H), 1.77 (dt, J = 23.6, 7.4 Hz, 4H), 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 6H) ESI MS(m/z):343.55 [M+1].
150	二异丁基((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diisobutyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.28 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.97 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 8.64 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 7.65-7.62 (m, 1H), 7.56 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 3.31-3.24 (m, 4H), 2.36-2.26 (m, 2H), 1.21-0.98 (m, 12H); ESI MS(m/z):371.65 [M+1].
151	(3-甲氧基吡啶-2-基)(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((3-methoxypyridin-2-yl)(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.93 (s, 1H), 8.62 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.23 (dd, J = 4.4, 1.2 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 8.6, 1.2 Hz, 1H), 7.66-7.60 (m, 2H), 7.43 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.56 (s, 3H); ESI MS(m/z):380.45 [M+1].
152	(3-氟吡啶-2-基)(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((3-fluoropyridin-2-yl)(methyl)((2-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.24 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.97 (s, 1H), 8.63 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.58 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.01 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 7.81-7.77 (m, 1H), 7.65-7.60 (m, 1H), 7.50 (d, J

[0559]

	(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	= 2.7 Hz, 1H), 3.66 (s, 3H); ESI MS(m/z):368.45 [M+1].
153	(2-氯吡啶-3-基)(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((2-chloropyridin-3-yl)(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.88 (t, J = 3.8 Hz, 1H), 8.62-8.59 (m, 2H), 8.56 (dd, J = 7.6, 1.8 Hz, 1H), 8.37-8.34 (m, 2H), 7.68 (dd, J = 7.8, 4.7 Hz, 1H), 7.58 (ddd, J = 8.4, 4.7, 0.6 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 3.68 (s, 3H); ESI MS(m/z):384.5 [M+1].
154	(5-氯吡啶-3-基)(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((5-chloropyridin-3-yl)(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.24 (dd, J = 7.3, 2.8 Hz, 1H), 9.07 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.93-8.88 (m, 2H), 8.64-8.61 (m, 1H), 8.52 (t, J = 2.1 Hz, 1H), 8.41-8.37 (m, 2H), 7.64-7.60 (m, 1H), 7.46 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 3.65 (d, J = 8.3 Hz, 3H) ESI MS(m/z):384.45 [M+1].
155	1-((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.29 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.98 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 8.64 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.45 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 7.66-7.62 (m, 1H), 7.51 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.50-3.41 (m, 2H), 3.34 (s, 1H), 3.29 (t, J = 7.0 Hz, 1H), 2.32-2.19 (m, 2H), 2.18-2.08 (m, 2H); ESI MS(m/z):313.5 [M+1].
156	异丙基(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (isopropyl(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.29 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.97 (s, 1H), 8.64 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.6, 5.1 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.58 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 3.12 (s, 3H), 1.41 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.37 (d, J = 6.8 Hz, 3H) ESI MS(m/z):315.5 [M+1].
157	甲基((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)(6-(三氟甲基)吡啶-3-基)-λ⁶-硫烷酮 (methyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)(6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.22 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.91 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 8.68-8.62 (m, 2H), 8.42 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.39 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.18 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.63-7.60 (m, 1H), 7.48 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 3.67 (d, J = 14.4 Hz, 3H); ESI MS(m/z):418.5 [M+1].
158	甲基(吡啶-2-基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (methyl(pyridin-2-yl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.23 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.91 (s, 1H), 8.78 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 8.62 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.39 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.30 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.18 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 8.11 (td, J = 7.7, 1.7 Hz, 1H), 7.68 (ddd, J = 7.5, 4.7, 1.2 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.1, 4.6 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.55 (s, 3H); ESI MS(m/z): 350.5 [M+1].
159	(5-氟吡啶-3-基)(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((5-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.23 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.91 (s, 1H), 8.82 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.63 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.39 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz,

[0560]

	fluoropyridin-3-yl)(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H), 8.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.27 (q, J = 4.4 Hz, 1H), 8.03 (td, J = 8.7, 2.9 Hz, 1H), 7.62 (ddd, J = 8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 5.75 (s, 1H), 3.56 (s, 2H); ESI MS(m/z):368.45 [M+1].
160	1-((2-(5-氯吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(5-chloropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.99 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.60 (t, J = 2.2 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.08 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.41-3.35 (m, 2H), 3.28-3.21 (m, 2H), 2.24-2.18 (m, 2H), 2.14-2.06 (m, 2H) ESI MS(m/z):368.45 [M+1].
161	1-((2-(2-甲基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(2-methylpyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.60 (dd, J = 4.8, 1.6 Hz, 1H), 8.48 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 7.8, 1.5 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.46 (dd, J = 7.7, 4.8 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.41-3.34 (m, 2H), 3.25-3.18 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.24-2.19 (m, 2H), 2.15-2.07 (m, 3H); ESI MS(m/z):326.95 [M+1].
162	1-((2-(4-甲基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(4-methylpyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.65 (s, 1H), 8.56 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 8.50 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.51 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.41-3.34 (m, 2H), 3.25-3.18 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.24-2.18 (m, 2H), 2.15-2.08 (m, 2H); ESI MS(m/z):326.95 [M+1].
163	1-((2-(6-甲基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(6-methylpyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.11 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.87 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.28 (dd, J = 8.6, 2.7 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.10 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.41-3.34 (m, 2H), 3.26-3.16 (m, 2H), 2.54 (s, 3H), 2.27-2.05 (m, 4H); ESI MS(m/z):327.05 [M+1].
164	1-((2-(5-甲基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(5-methylpyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.06 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.90 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.27-8.26 (m, 1H), 7.58 (dt, J = 9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.10 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.41-3.34 (m, 2H), 3.26-3.20 (m, 2H), 2.42 (d, J = 0.5 Hz, 3H), 2.26-2.07 (m, 4H); ESI MS(m/z):326.65 [M+1].
165	((2-(5-氯吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二甲基-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-chloropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)dimethyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.98 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.60 (t, J = 2.3 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.14 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.23 (s, 6H); ESI MS(m/z):320.9 [M+1].
166	二甲基((2-(5-(三氟甲基)吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dimethyl((2-(5-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.60 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.10 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.00 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.78 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.15 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.24 (s, 6H); ESI MS(m/z):354.85 [M+1].
167	((2-(5-甲氧基吡啶-3-基)-2H-吲	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.96 (d, J = 0.9

[0561]

	唑-5-基)亚胺基)二甲基-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-methoxypyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)dimethyl-λ⁶-sulfanone)	Hz, 1H), 8.87 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.99 (t, J = 2.3 Hz, 1H), 7.59-7.56 (m, 1H), 7.15-7.14 (m, 1H), 6.97 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.23 (s, 6H); ESI MS(m/z):316.5 [M+1].
168	二甲基((2-(5-甲基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dimethyl((2-(5-methylpyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.06 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.90 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.27-8.26 (m, 1H), 7.56 (dt, J = 9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.16-7.15 (m, 1H), 6.96 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.22 (s, 6H), 2.42 (d, J = 0.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z):300.55 [M+1].
169	1-((2-(2,6-二甲基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(2,6-dimethylpyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.43 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.14 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.41-3.34 (m, 2H), 3.24-3.18 (m, 2H), 2.53 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.25-2.19 (m, 2H), 2.16-2.05 (m, 2H); ESI MS(m/z):341 [M+1].
170	1-((2-(5-甲氧基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(5-methoxypyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.96 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.88 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.99 (t, J = 2.4 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.09 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.98-3.91 (m, 3H), 3.41-3.35 (m, 2H), 3.27-3.20 (m, 2H), 2.28-2.05 (m, 5H); ESI MS(m/z):342.95 [M+1].
171	1-((2-(5-(三氟甲基)吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(5-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.60 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.10 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.00 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.79 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.09 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.42-3.35 (m, 2H), 3.29-3.22 (m, 2H), 2.26-2.06 (m, 4H); ESI MS(m/z):380.85 [M+1].
173	二甲基((2-(2-甲基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dimethyl((2-(2-methylpyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.60 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.48 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 7.9, 1.5 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.45 (q, J = 4.1 Hz, 1H), 7.19 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.22 (s, 6H), 2.43 (s, 3H); ESI MS(m/z):300.55 [M+1].
174	二甲基((2-(6-甲基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dimethyl((2-(6-methylpyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.11 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.87 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.28 (dd, J = 8.3, 2.7 Hz, 1H), 7.56 (dt, J = 9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.15 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.22 (s, 6H), 2.52 (d, J = 9.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z):300.5 [M+1].
175	二甲基((2-(4-甲基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dimethyl((2-(4-methylpyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.64 (s, 1H), 8.56 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.57-7.55 (m, 1H), 7.51 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 7.19 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.22 (s, 6H), 2.30 (d, J = 5.5 Hz, 3H) ESI MS(m/z):300.55 [M+1].
176	((2-(2,6-二甲基吡啶-3-基)-2H-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.42 (d, J = 0.9

[0562]

	吲唑-5-基)亚胺基)二甲基-λ⁶-硫烷酮 (((2-(2,6-dimethylpyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)dimethyl-λ⁶-sulfanone)	Hz, 1H), 7.77 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.55 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.18 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.21 (s, 6H), 2.53 (s, 3H), 2.36 (s, 3H); ESI MS(m/z):314.95 [M+1].
177	((3-氯-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二甲基-λ⁶-硫烷酮 (((3-chloro-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)dimethyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.37 (s, 1H), 9.29 (s, 2H), 7.61 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.28-3.22 (m, 6H); ESI MS(m/z):321.7 [M+1].
178	((3-氯-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(异丙基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 (((3-chloro-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(isopropyl)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 32.7 Hz, 2H), 7.61-7.59 (m, 1H), 7.08 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 7.02 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.56 (s, 1H), 3.08 (s, 3H), 1.40 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.35 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS(m/z):349.95 [M+1].
179	1-((3-氯-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((3-chloro-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.37 (s, 1H), 9.29 (s, 2H), 7.62 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 6.93 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.43-3.36 (m, 2H), 3.27 (t, J = 7.0 Hz, 1H), 2.28-2.19 (m, 2H), 2.15-2.08 (m, 2H); ESI MS(m/z):347.9 [M+1].
180	((3-氯-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)(丙基)-λ⁶-硫烷酮 (((3-chloro-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)(propyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.37 (s, 1H), 9.29 (s, 2H), 7.60 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 7.00 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.37 (dd, J = 9.9, 6.0 Hz, 2H), 3.17 (s, 3H), 1.79 (dd, J = 16.8, 7.5 Hz, 2H), 0.98 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):349.9 [M+1].
181	((3-氯-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二异丁基-λ⁶-硫烷酮 (((3-chloro-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)diisobutyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.37 (s, 1H), 9.30-9.26 (m, 2H), 7.59 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.07 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.00 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.28-3.21 (m, 4H), 2.34-2.27 (m, 2H), 1.06-1.00 (m, 12H); ESI MS(m/z):406.05 [M+1].
184	二丙基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dipropyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.49 (s, 2H), 9.25 (s, 1H), 9.02 (s, 1H), 8.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.38-3.34 (m, 4H), 1.77 (dt, J = 23.6, 7.2 Hz, 4H), 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):345.05 [M+1].
185	二异丁基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diisobutyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.51 (d, J = 10.0 Hz, 2H), 9.25 (t, J = 4.9 Hz, 1H), 9.02 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.35 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 3.28 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 2.36-2.26 (m, 2H), 1.06-0.98 (m, 12H); ESI MS(m/z):373.05 [M+1].
186	1-((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.51 (s, 2H), 9.25 (s, 1H), 9.04 (s, 1H), 8.36 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.48-3.42 (m, 2H), 3.35 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 3.29 (s, 1H), 2.26-2.10 (m, 4H); ESI MS(m/z):314.85[M+1].

[0563]

	yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	
187	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)二甲基-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)dimethyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.22 (s, 1H), 9.02 (s, 1H), 8.68 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.48 (dt, J = 10.1, 2.4 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.30 (s, 6H) ESI MS(m/z):305.905[M+1].
188	1-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.22 (s, 1H), 9.02 (s, 1H), 8.68 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.48 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.35 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 3.48-3.41 (m, 2H), 3.34 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 3.28 (s, 1H), 2.26-2.20 (m, 2H), 2.17-2.11 (m, 2H); ESI MS(m/z):376.9[M+1].
189	((3-氯-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二丙基-λ⁶-硫烷酮 (((3-chloro-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)dipropyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.92 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.74 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.20-8.17 (m, 1H), 7.67 (dd, J = 7.9, 4.6 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.30-3.26 (m, 4H), 1.78-1.70 (m, 4H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z): 320.8[M+1].
190	((3-氯-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二甲基-λ⁶-硫烷酮 (((3-chloro-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)dimethyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.95 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.76 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.22-8.19 (m, 1H), 7.68 (dd, J = 8.2, 4.8 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.99 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 3.25 (s, 6H) ESI MS(m/z):331.9[M+1].
191	1-((3-氯-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((3-chloro-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.95-8.95 (m, 1H), 8.76 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.21 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.68 (ddd, J = 8.3, 4.9, 0.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.93 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.39 (td, J = 13.1, 6.6 Hz, 2H), 3.26 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.28-2.19 (m, 2H), 2.15-2.08 (m, 2H); ESI MS(m/z):346.85[M+1].
192	((3-氯-2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二丙基-λ⁶-硫烷酮 (((3-chloro-2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)dipropyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.89 (t, J = 1.4 Hz, 1H), 8.82 (d, J = 3.1 Hz, 1H), 8.30 (dt, J = 9.5, 2.3 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.35 (s, 1H), 3.29 (s, 3H), 1.81-1.71 (m, 4H), 0.98 (q, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):394.9[M+1].
193	乙基(异丙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(isopropyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.49 (s, 2H), 9.25 (s, 1H), 9.01 (s, 1H), 8.38 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.62 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 3.37 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.39 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.32 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):331.05[M+1].
194	丁基((3-氯-2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(乙基)-λ⁶-硫烷酮 (butyl((3-chloro-2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.89 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.82 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.31 (dt, J = 9.4, 2.3 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.07 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.36 (t,

[0564]

	yl)imino)(ethyl)-λ^6-sulfanone)	J = 7.5 Hz, 3H), 3.30 (s, 1H), 1.76-1.68 (m, 2H), 1.39 (td, J = 14.7, 7.4 Hz, 2H), 1.29-1.22 (m, 3H), 0.88 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):394.9[M+1].
195	丁基((3-氯-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(乙基)-λ^6-硫烷酮 (butyl((3-chloro-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(ethyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.95 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.75 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.20 (dq, J = 8.2, 1.3 Hz, 1H), 7.70-7.66 (m, 1H), 7.58-7.56 (m, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.00 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 3.35 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 3.27-3.23 (m, 2H), 1.76-1.68 (m, 2H), 1.39 (td, J = 14.8, 7.5 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.88 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):377.1[M+1].
196	((3-氯-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(乙基)(异丙基)-λ^6-硫烷酮 (((3-chloro-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(ethyl)(isopropyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.95 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.75 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.20 (dq, J = 8.2, 1.3 Hz, 1H), 7.68 (ddd, J = 8.3, 4.9, 0.6 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.09 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.02 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.60-3.54 (m, 1H), 3.35-3.32 (m, 1H), 3.29 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 1.38 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.31 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.25 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z):363[M+1].
197	((3-氯-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)(丙基)-λ^6-硫烷酮 (((3-chloro-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)(propyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.95 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.75 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.20 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 7.8, 5.1 Hz, 1H), 7.59-7.57 (m, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.37 (dd, J = 9.8, 6.1 Hz, 2H), 3.16 (s, 3H), 1.82-1.74 (m, 2H), 1.00-0.91 (m, 3H); ESI MS(m/z):348.95[M+1].
198	((3-氯-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(异丙基)(甲基)-λ^6-硫烷酮 (((3-chloro-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(isopropyl)(methyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.95 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.75 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.20 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.72-7.66 (m, 1H), 7.58 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 7.01 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.58-3.52 (m, 1H), 3.07 (s, 3H), 1.40 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.35 (d, J = 7.0 Hz, 3H) ESI MS(m/z):348.95[M+1].
199	((3-氯-2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(乙基)(异丙基)-λ^6-硫烷酮 (((3-chloro-2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(ethyl)(isopropyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.89 (s, 1H), 8.82 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.30 (dt, J = 9.4, 2.3 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.11 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.01 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.61-3.54 (m, 1H), 3.33 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 3.29 (s, 1H), 1.38 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.34-1.29 (m, 3H), 1.27-1.21 (m, 3H) ESI MS(m/z):380.95[M+1].
200	((3-氯-2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)(丙基)-λ^6-硫烷酮 (((3-chloro-2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)(propyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.89 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.82 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.33-8.29 (m, 1H), 7.58 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 6.99 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.37 (dd, J = 9.6, 6.0 Hz, 2H), 3.17 (s, 3H), 1.79 (dd, J = 16.7, 7.5 Hz, 2H), 0.98 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):366.95[M+1].
201	((3-氯-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二乙基-λ^6-硫烷酮 (((3-chloro-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)diethyl-λ^6-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.37 (s, 1H), 9.29 (s, 2H), 7.59 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.09 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.36 (t, J = 7.3 Hz, 4H), 1.25 (q, J = 7.4 Hz, 6H); ESI MS(m/z):349.9[M+1].

[0565]

	sulfanone)	
202	((7-氯-2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)二乙基-λ⁶-硫烷酮 (((7-chloro-2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)dimethyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25 (s, 1H), 9.18 (s, 1H), 8.68 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.52 (dt, J = 10.0, 2.2 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 6.56 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 3.34 (s, 6H) ESI MS(m/z):338.85[M+1].
203	((3-氯-2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)(丙基)-λ⁶-硫烷酮 (((3-chloro-2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)(propyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.79 (s, 1H), 9.49 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.61 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 6.97 (s, 1H), 3.38 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 3.18 (s, 3H), 1.79 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 0.98 (t, J = 7.2 Hz, 3H) ESI MS(m/z):349.95[M+1].
204	((3-chloro-2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二乙基-λ⁶-硫烷酮 (((3-chloro-2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)diethyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.79 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.49 (dd, J = 5.7, 1.1 Hz, 1H), 8.23 (q, J = 2.8 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 7.10 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.98 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.36 (q, J = 7.4 Hz, 4H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):350[M+1].
205	((3-氯-2-(哒嗪-4-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(乙基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮 (((3-chloro-2-(pyridazin-4-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(ethyl)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.79 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.49 (dd, J = 5.8, 0.9 Hz, 1H), 8.23 (q, J = 2.8 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 7.14-7.10 (m, 1H), 7.00-6.98 (m, 1H), 3.58 (td, J = 13.7, 6.8 Hz, 1H), 3.35 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 1.41-1.37 (m, 3H), 1.34-1.30 (m, 3H), 1.29-1.20 (m, 3H) ESI MS(m/z):363.9[M+1].
206	((7-氯-2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)(异丙基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 (((7-chloro-2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)(isopropyl)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (s, 1H), 9.20 (s, 1H), 8.68 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 10.0, 2.4 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 6.59 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 3.60 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 3.17 (s, 3H), 1.48 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.42 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS(m/z):366.9[M+1].
207	二乙基((2-(2-甲基嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(2-methylpyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.34 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 8.93 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.17 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.35-3.32 (m, 2H), 3.30-3.27 (m, 2H), 2.70 (s, 3H), 1.31-1.17 (m, 6H) ESI MS(m/z):329.95[M+1].
208	环己基(甲基)((2-(2-甲基嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (cyclohexyl(methyl)((2-(2-methylpyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.35 (d, J = 14.2 Hz, 2H), 8.93 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.58-7.55 (m, 1H), 7.17 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.03 (s, 3H), 2.76 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 2.70 (s, 3H), 2.10-2.04 (m, 1H), 1.64 (d, J = 12.2 Hz, 2H), 1.58-1.39 (m, 2H), 1.36-1.09 (m, 6H) ESI MS(m/z):370.0[M+1].
209	异丙基(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-7-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (isopropyl(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-7-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.29 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.06 (s, 1H), 8.62 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.43 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.63 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 8.3, 0.7 Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.3, 7.1 Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 7.2, 0.9 Hz, 1H), 3.16 (d, J = 4.9 Hz, 4H), 1.46 (d, J = 6.8 Hz, 3H),

[0566]

		1.40 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS(m/z):315.0[M+1].
210	二异丁基((2-(2-甲基嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diisobutyl((2-(2-methylpyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (s, 2H), 8.93 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.28-3.15 (m, 4H), 2.70 (s, 3H), 2.32-2.24 (m, 2H), 1.03 (dd, J = 8.4, 6.7 Hz, 12H) ESI MS(m/z):386.2[M+1].
211	(2-甲氧基乙基)(甲基)((2-(2-甲基嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((2-methoxyethyl)(methyl)((2-(2-methylpyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.34 (s, 2H), 8.94 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.59 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.74 (t, J = 5.6 Hz, 2H), 3.61 (t, J = 5.4 Hz, 2H), 3.28 (s, 3H), 3.17 (s, 3H), 2.70 (s, 3H) ESI MS(m/z):346.05[M+1].
212	3-(5-(((2-methoxyethyl)(甲基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)胺基)-2H-吲唑-2-基)异烟腈 (3-(5-(((2-methoxyethyl)(methyl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)amino)-2H-indazol-2-yl)isonicotinonitrile)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (s, 1H), 8.87 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.84 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.12 (dd, J = 5.0, 0.6 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.21 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.74 (t, J = 5.5 Hz, 2H), 3.64 (d, J = 5.4 Hz, 2H), 3.29 (s, 3H), 3.18 (s, 3H); ESI MS(m/z): 356.0[M+1].
213	异丙基(甲基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (isopropyl(methyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.08 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.82 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 3.36 (s, 3H), 1.39 (dd, J = 11.9, 7.0 Hz, 6H); ESI MS (m/z):317.00[M+1].
214	丁基(乙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (butyl(ethyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.01 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.5, 1.4 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.62-7.58 (m, 1H), 6.79 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.62-3.53 (m, 4H), 1.76-1.66 (m, 2H), 1.41 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 1.28 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 0.89 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):344.05[M+1].
215	二异丁基((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diisobutyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.02 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.59 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.61-7.58 (m, 1H), 6.79 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.60 (dd, J = 13.9, 6.3 Hz, 2H), 3.42 (dd, J = 14.1, 6.4 Hz, 2H), 2.34-2.27 (m, 2H), 1.05-0.97 (m, 12H); ESI MS (m/z):356.10[M+1].
216	环己基(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (cyclohexyl(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 7.62-7.59 (m, 1H), 6.78 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.57-3.51 (m, 1H), 3.36 (s, 3H), 2.23 (d, J = 12.2 Hz, 1H), 2.14 (d, J = 12.5 Hz, 1H), 1.87 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 1.67 (d, J = 12.5 Hz, 1H), 1.58-1.47 (m, 2H), 1.35-1.27 (m, 2H), 1.24-1.16 (m, 1H); ESI MS (m/z):356.10 [M+1].
217	((7-氯-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.11 (s, 1H), 8.64 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H),

[0567]

	基)亚胺基)二甲基-λ⁶-硫烷酮 (((7-chloro-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)dimethyl-λ⁶-sulfanone)	8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.64-7.60 (m, 1H), 7.24 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 6.56 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 3.33 (s, 6H); ESI MS(m/z):320.85[M+1].
218	((7-氯-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)亚胺基)(异丙基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 (((7-chloro-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)imino)(isopropyl)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.12 (d, J = 11.7 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.64-7.61 (m, 1H), 7.22 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 6.59 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 3.63-3.56 (m, 1H), 3.16 (s, 3H), 1.47 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.41 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 348.9 [M+1].
219	二乙基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.46 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.07 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.3, 1.0 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.58 (q, J = 7.3 Hz, 4H), 1.28 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS (m/z):317.00[M+1].
220	丁基(乙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (butyl(ethyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.07 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.62-3.54 (m, 4H), 1.78-1.65 (m, 2H), 1.45-1.38 (m, 2H), 1.28 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 0.89 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):345.10[M+1].
221	二异丁基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diisobutyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.20 (s, 1H), 9.07 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.61 (dd, J = 13.9, 6.4 Hz, 2H), 3.42 (dd, J = 13.9, 6.4 Hz, 2H), 2.36-2.26 (m, 2H), 1.08-1.02 (m, 12H) ESI MS (m/z):373.15[M+1].
222	甲基(丙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (methyl(propyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.43-9.51 (2H), 9.18-9.24 (1H), 9.05-9.12 (1H), 7.92-8.01 (1H), 6.75-6.85 (1H), 3.48-3.66 (2H), 3.35-3.43 (3H), 1.66-1.91 (2H), 0.93-1.07 (3H) ESI MS (m/z):317.00[M+1].
223	环己基(甲基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (cyclohexyl(methyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.09 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.58-3.52 (m, 1H), 3.36 (s, 3H), 2.18 (dd, J = 34.4, 12.4 Hz, 2H), 1.86 (s, 2H), 1.67 (d, J = 11.9 Hz, 1H), 1.56-1.48 (m, 2H), 1.34-1.16 (m, 3H); ESI MS (m/z):357.10 [M+1].
224	二甲基((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dimethyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.3, 1.0 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 8.4, 4.7, 0.6 Hz, 1H), 6.76 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.43 (s, 6H); ESI MS (m/z):287.95[M+1].
229	二甲基((2-(吡啶-3-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.29 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.08 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.66 (dd, J = 4.8,

[0568]

	硫烷酮 (dimethyl((2-(pyridin-3-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1.3 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.65 (ddd, J = 8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.46 (s, 1H), 3.22 (s, 6H); ESI MS(m/z):355.0 [M+1].
232	二甲基((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (dimethyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.19 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 9.17 (s, 1H), 8.71 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.29 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.52 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.40 (s, 6H) ESI MS (m/z):288.0[M+1].
233	二异丁基((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-7-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (diisobutyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-7-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.04 (s, 1H), 8.62 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.43-8.40 (m, 1H), 7.63 (dd, J = 8.4, 4.8 Hz, 1H), 7.22 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 6.93-6.90 (m, 1H), 6.81 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 3.39 (dd, J = 14.2, 6.1 Hz, 2H), 3.30-3.26 (m, 2H), 2.35 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 1.05 (q, J = 6.5 Hz, 12H); ESI MS(m/z):371.10[M+1].
234	(2-甲氧基乙基)(甲基)((2-(吡啶-3-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 ((2-methoxyethyl)(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.17 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.68 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.25 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.50 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 3.97-3.92 (m, 1H), 3.88-3.81 (m, 1H), 3.45 (t, J = 5.0 Hz, 2H), 3.41-3.39 (m, 3H), 3.15 (s, 3H) ESI MS(m/z):399.10[M+1].
235	异丙基(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (isopropyl(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.19 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.15 (s, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.28 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 3.80-3.73 (m, 1H), 3.22 (s, 3H), 1.57 (dd, J = 12.4, 5.3 Hz, 3H), 1.52 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS (m/z):316.1[M+1].
236	(2-甲氧基乙基)(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 ((2-methoxyethyl)(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.04 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.6, 4.9 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.97-3.85 (m, 2H), 3.83-3.75 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 3.31 (s, 3H) ESI MS (m/z):332.00[M+1].
237	(2-甲氧基乙基)(甲基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 ((2-methoxyethyl)(methyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.09 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.98-3.85 (m, 2H), 3.84-3.77 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 3.31 (s, 3H); ESI MS (m/z):333.00[M+1].
238	异丙基(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (isopropyl(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.03 (s, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.86-3.79 (m, 1H), 3.37 (d, J = 8.9 Hz, 3H), 1.41-1.31 (m, 6H); ESI MS (m/z):316.00[M+1].

[0569]

239	甲基(丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (methyl(propyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.60 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 6.77 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.59-3.54 (m, 2H), 3.38 (s, 3H), 1.83-1.76 (m, 2H), 1.00 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z):316.05[M+1].
240	乙基(异丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (ethyl(isopropyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.01 (s, 1H), 8.59 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 3.94-3.87 (m, 1H), 3.69-3.59 (m, 2H), 1.37 (dd, J = 9.2, 7.0 Hz, 6H), 1.28 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):330.05[M+1].
241	乙基(异丙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (ethyl(isopropyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.46 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.06 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.90 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 3.64 (qd, J = 7.2, 4.5 Hz, 2H), 1.37 (dd, J = 8.6, 6.7 Hz, 6H), 1.28 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):331.00[M+1].
242	二甲基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (dimethyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.29 (s, 1H), 9.10 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 9.08 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.36 (s, 6H); ESI MS (m/z):288.9[M+1].
243	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)二甲基-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)dimethyl-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25 (s, 1H), 9.07 (dd, J = 10.0, 1.0 Hz, 2H), 8.72 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.51 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.36 (s, 6H) ESI MS(m/z):305.9[M+1].
244	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)(异丙基)(甲基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)(isopropyl)(methyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25 (s, 1H), 9.07 (dd, J = 5.1, 1.0 Hz, 2H), 8.72 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.53 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.70 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 3.24 (s, 3H), 1.41 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.36 (d, J = 6.8 Hz, 3H) ESI MS(m/z):334.15[M+1].
245	二乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (diethyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25 (s, 1H), 9.06 (s, 2H), 8.72 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.52 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 3.52-3.41 (m, 4H), 1.29-1.22 (m, 6H) ESI MS(m/z):334.15[M+1].
246	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)(甲基)(丙基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6)1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25 (s, 1H), 9.08-9.06 (m, 2H), 8.72 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.52 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.49 (t, J = 7.9 Hz, 2H), 3.31 (s, 3H), 1.84-1.73 (m, 2H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z):334.15[M+1].

[0570]

	yl)imino)(methyl)(propyl)-λ⁶-sulfanone)	
247	1-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (s, 1H), 9.10-9.08 (m, 2H), 8.73 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.53 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 2H), 3.35 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 3.30 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 2.24-2.06 (m, 4H) ESI MS(m/z):331.9[M+1].
248	乙基(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.60 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 3.36 (s, 3H), 1.31 (t, J = 7.5 Hz, 3H) ESI MS(m/z):301.910[M+1].
249	二乙基((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.02 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.57 (q, J = 7.4 Hz, 4H), 1.28 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS(m/z):315.9 [M+1].
250	1-((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.06 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.43 (dq, J = 8.5, 1.4 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.61 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.67-3.60 (m, 2H), 3.35 (q, J = 6.7 Hz, 2H), 2.24-2.19 (m, 2H), 2.15-2.10 (m, 2H); ESI MS(m/z):313.9[M+1].
251	异丙基(甲基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (isopropyl(methyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.29 (s, 1H), 9.10-9.09 (m, 2H), 6.84 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.74-3.67 (m, 1H), 3.25 (s, 3H), 1.41 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 1.36 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS(m/z):317[M+1].
252	甲基(丙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (methyl(propyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (d, J = 3.1 Hz, 2H), 9.30 (d, J = 10.7 Hz, 1H), 9.09 (dd, J = 5.0, 1.1 Hz, 2H), 6.82 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.51-3.46 (m, 2H), 3.29 (s, 3H), 1.84-1.73 (m, 2H), 1.01-0.96 (m, 3H); ESI MS(m/z):317.05[M+1].
253	二甲基((2-(嘧啶-5-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dimethyl((2-(pyrimidin-5-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (s, 2H), 9.28 (s, 1H), 9.14 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.46 (s, 1H), 3.24 (d, J = 4.9 Hz, 6H); ESI MS(m/z):355.85[M+1].
254	异丙基(丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (isopropyl(propyl)((2-(pyridin-3-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.02 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.59 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H),

[0571]

	yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	6.80 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.97-3.90 (m, 1H), 3.63-3.49 (m, 2H), 1.85-1.69 (m, 2H), 1.37 (dd, J = 8.9, 7.0 Hz, 6H), 0.99 (t, J = 7.3 Hz, 3H) ESI MS(m/z):344.05[M+1].
255	二异丙基((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (diisopropyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.00 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.59 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.93 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.97-3.91 (m, 2H), 1.40 (q, J = 7.1 Hz, 12H); ESI MS(m/z):344.05 [M+1].
256	异丙基(丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (isopropyl(propyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.91 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.62-7.59 (m, 1H), 7.55 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 1H), 3.28-3.21 (m, 2H), 1.78-1.69 (m, 2H), 1.37 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 1.30 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 0.96 (td, J = 7.3, 3.4 Hz, 3H); ESI MS(m/z):343.1[M+1].
257	异丙基(丙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (isopropyl(propyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.97 (s, 1H), 7.57 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.18 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.53 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 3.25 (dd, J = 16.0, 7.5 Hz, 2H), 1.74 (q, J = 7.7 Hz, 2H), 1.37 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.30 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z):344.1[M+1].
258	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(异丙基)(丙基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(isopropyl)(propyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (s, 1H), 8.95 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.2, 2.4 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 1H), 3.25-3.21 (m, 2H), 1.79-1.69 (m, 2H), 1.36 (t, J = 6.7 Hz, 3H), 1.31 (t, J = 6.4 Hz, 3H), 0.97-0.93 (m, 3H);ESI MS(m/z):360.95[M+1].
259	((4-氯-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二乙基-λ^6-硫烷酮 (((4-chloro-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)diethyl-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.24 (s, 1H), 9.14 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.34 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 3.29 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 1.29 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z):349.80[M+1].
260	((4-氯-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(乙基)(异丙基)-λ^6-硫烷酮 (((4-chloro-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(ethyl)(isopropyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.53 (s, 2H), 9.23 (s, 1H), 9.13 (s, 1H), 7.57 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.41 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.57-3.50 (m, 1H), 3.29-3.27 (m, 2H), 1.40 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.32 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 3H) ESI MS (m/z):363.90[M+1].
261	((4-氯-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)(丙基)-λ^6-硫烷酮 (((4-chloro-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)(propyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.24 (s, 1H), 9.15 (s, 1H), 7.60 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.36 (dd, J = 9.7, 6.2 Hz, 2H), 3.16 (s, 3H), 1.87-1.79 (m, 2H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z):349.80[M+1].
262	((4-氯-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.24

[0572]

	基)亚胺基)(2-甲氧基乙基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 (((4-chloro-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(2-methoxyethyl)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	(s, 1H), 9.17 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.85-3.80 (m, 1H), 3.77-3.72 (m, 1H), 3.69-3.56 (m, 2H), 3.29 (s, 3H), 3.19 (s, 3H); ESI MS (m/z):366.00 [M+1].
263	((4-氯-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二甲基-λ⁶-硫烷酮 (((4-chloro-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)dimethyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.24 (s, 1H), 9.16 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.9, 0.9 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.25 (s, 6H); ESI MS (m/z):321.80[M+1].
264	二乙基((2-(吡啶-3-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(pyridin-3-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) d 9.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.05 (s, 1H), 8.66 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.45-8.42 (m, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.65 (dd, J = 8.4, 5.0 Hz, 1H), 7.45 (s, 1H), 3.35 (q, J = 7.4 Hz, 4H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z): 382.85[M+1].
265	乙基(异丙基)((2-(吡啶-3-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(isopropyl)((2-(pyridin-3-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.28 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.04 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.66 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.43 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.65 (q, J = 4.6 Hz, 1H), 7.46 (s, 1H), 3.57 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.36 (dd, J = 15.4, 7.3 Hz, 2H), 1.36 (q, J = 6.7 Hz, 6H), 1.27-1.21 (m, 3H) ESI MS(m/z):397.05[M+1].
266	乙基(异丙基)((2-(嘧啶-5-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(isopropyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.49 (s, 2H), 9.27 (s, 1H), 9.10 (s, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.46 (s, 1H), 3.62-3.55 (m, 1H), 3.37 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 1.36 (q, J = 6.7 Hz, 6H), 1.27-1.22 (m, 4H); ESI MS(m/z):397.95[M+1].
267	(3-氟苯基)(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((3-fluorophenyl)(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.21 (s, 1H), 8.64 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.45 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 7.9, 2.8 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 7.9, 5.2 Hz, 3H), 7.49-7.47 (m, 1H), 6.91 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.38-3.39 (3H); ESI MS(m/z):367.95[M+1].
268	乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (s, 1H), 9.08 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.46 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.44 (s, 1H), 3.58 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 3.36 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 1.36 (q, J = 6.7 Hz, 6H), 1.23 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z):415[M+1].
269	二乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (s, 1H), 9.09 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.46 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.43 (s, 1H), 3.36 (q, J = 7.3 Hz, 4H), 1.26 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS(m/z):401.05[M+1].

[0573]

270	((2-(5-氟吡啶-3-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二甲基-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)dimethyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.22 (s, 1H), 9.12 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.47 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.44 (s, 1H), 3.23 (s, 6H); ESI MS(m/z):373[M+1].
271	二丙基((2-(吡啶-3-基)-7-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dipropyl((2-(pyridin-3-yl)-7-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.13 (s, 1H), 8.66 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.3, 5.4 Hz, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.33 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 3.33 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 3.30 (s, 2H), 1.80-1.72 (m, 4H), 0.97 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):411 [M+1].
272	二甲基((2-(吡啶-3-基)-7-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dimethyl((2-(pyridin-3-yl)-7-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.14 (s, 1H), 8.66 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.43 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.3, 4.6 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 3.27 (s, 6H); ESI MS(m/z): 354.85 [M+1].
273	二甲基((3-甲基-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dimethyl((3-methyl-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.89 (s, 1H), 8.70 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.12 (dt, J = 8.2, 1.2 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 7.5, 4.7 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.96 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.21 (dd, J = 17.3, 16.0 Hz, 6H), 2.59 (s, 3H) ESI MS(m/z):301.05[M+1].
274	二丙基((2-(吡啶-3-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dipropyl((2-(pyridin-3-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.28 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.05 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.66 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.45 (s, 1H), 3.33 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 3.28 (s, 2H), 1.81-1.71 (m, 4H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):410.95[M+1].
275	((2-(5-氟吡啶-3-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二丙基-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)dipropyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (s, 1H), 9.09 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.46 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.43 (s, 1H), 3.33 (s, 2H), 3.28 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 1.81-1.71 (m, 4H), 0.96 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS(m/z):428.95[M+1].
276	乙基(异丙基)((3-甲基-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(isopropyl)((3-methyl-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.90 (s, 1H), 8.70 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 7.6, 4.3 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.11 (s, 1H), 7.03 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 1H), 3.26 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 2.62 (d, J = 30.3 Hz, 3H), 1.38-1.22 (m, 9H); ESI MS(m/z):343.15[M+1].
277	异丙基((3-甲基-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(丙基)-λ⁶-硫烷酮 (isopropyl((3-methyl-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(propyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.89 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.69 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.14-8.11 (m, 1H), 7.63 (dd, J = 8.1, 4.7 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.54-3.47 (m, 1H), 3.26-3.19 (m, 2H), 2.58 (s, 3H), 1.74 (dt, J = 23.1, 7.4 Hz, 2H), 1.37 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.31 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 0.97 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS(m/z):357.05[M+1].
278	二丙基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.53 (s, 2H), 9.29

[0574]

	并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dipropyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	(s, 1H), 9.08-9.07 (m, 2H), 6.83 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.48-3.41 (m, 4H), 1.84-1.68 (m, 4H), 0.98 (t, J = 7.5 Hz, 6H) ESI MS(m/z):345.15[M+1].
279	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)二丙基-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)dipropyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25 (s, 1H), 9.07-9.05 (m, 2H), 8.72 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.52 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 3.48-3.40 (m, 4H), 1.84-1.68 (m, 4H), 0.98 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z):362.1[M+1].
280	二异丙基((3-甲基-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diisopropyl((3-methyl-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.89 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.69 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.13 (dq, J = 8.1, 1.4 Hz, 1H), 7.65-7.61 (m, 1H), 7.43 (dd, J = 9.0, 0.8 Hz, 1H), 7.12-7.08 (m, 2H), 3.62-3.56 (m, 2H), 2.57 (s, 3H), 1.34 (d, J = 7.0 Hz, 6H), 1.27 (d, J = 6.7 Hz, 6H); ESI MS(m/z):357.05[M+1].
281	((3-甲基-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二丙基-λ⁶-硫烷酮 (((3-methyl-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)dipropyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.89 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.13 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.65-7.62 (m, 1H), 7.46 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.09 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.28-3.24 (m, 4H), 2.58 (s, 3H), 1.79-1.71 (m, 4H), 0.96 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS(m/z):357.10[M+1].
282	二乙基((3-甲基-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((3-methyl-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.89 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.14-8.11 (m, 1H), 7.64 (dd, J = 8.1, 4.7 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.34-3.25 (m, 4H), 2.58 (s, 3H), 1.26 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):328.9[M+1].
283	异丙基(甲基)((3-甲基-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (isopropyl(methyl)((3-methyl-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.89 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.13 (dq, J = 8.1, 1.4 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.1, 4.7 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.50 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 3.02 (s, 3H), 2.59 (s, 3H), 1.37 (dd, J = 19.7, 6.9 Hz, 6H); ESI MS(m/z):328.9[M+1].
284	乙基(甲基)((3-甲基-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(methyl)((3-methyl-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.89 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.13 (dq, J = 8.1, 1.4 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.48-7.46 (m, 1H), 7.10 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.35 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.59 (s, 3H), 1.29 (t, J = 7.3 Hz, 3H) ESI MS(m/z):315.0[M+1].
285	二丙基((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dipropyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.05 (t, J = 1.2 Hz, 1H), 9.01 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.68 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.48 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.65 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.44 (t, J = 7.9 Hz, 4H), 1.82-1.70 (m, 4H), 0.98 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):344.05 [M+1].
286	甲基(丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.06 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 9.01 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.68 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.4,

[0575]

	基)-λ⁶-硫烷酮 (methyl(propyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1.3 Hz, 1H), 7.67-7.63 (m, 1H), 6.81 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.51-3.45 (m, 2H), 3.28 (s, 3H), 1.84-1.73 (m, 2H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS(m/z): 316[M+1].
287	仲丁基(异丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (sec-butyl(isopropyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.00 (s, 1H), 8.59 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.92 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 6.84 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 3.87 (td, J = 13.0, 6.4 Hz, 1H), 3.78-3.71 (m, 1H), 2.15-2.05 (m, 1H), 1.68-1.53 (m, 1H), 1.43-1.37 (m, 9H), 0.98 (q, J = 7.1 Hz, 3H) ESI MS(m/z):357.95[M+1].
288	(环丙基甲基)(异丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclopropylmethyl)(isopropyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.02 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.62-7.58 (m, 1H), 6.81 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.82 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 3.70 (dq, J = 25.9, 7.2 Hz, 2H), 1.39 (dd, J = 8.4, 6.9 Hz, 6H), 1.07-1.05 (m, 1H), 0.62-0.54 (m, 2H), 0.40-0.31 (m, 2H) ESI MS(m/z):355.95[M+1].
289	(环丙基甲基)(异丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclobutylmethyl)(isopropyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.02 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.59 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.93 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J = 8.4, 4.7, 0.6 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.85-3.67 (m, 3H), 2.12-2.02 (m, 2H), 1.90-1.73 (m, 5H), 1.35 (dd, J = 6.7, 4.9 Hz, 6H); ESI MS(m/z):370 [M+1].
290	1-((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)六氢-λ⁶-噻喃 1-氧化物 (1-((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)hexahydro-λ⁶-thiopyran 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.01 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.5, 1.4 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.75-3.71 (m, 2H), 3.49-3.43 (m, 2H), 1.99-1.81 (m, 2H), 1.63-1.58 (m, 2H), 1.25-1.22 (m, 2H); ESI MS(m/z):327.9[M+1].
291	仲丁基(异丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (sec-butyl(isopropyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.89 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.59 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.40 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.1, 5.0 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.18 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.07 (dt, J = 9.2, 2.4 Hz, 1H), 3.37 (qd, J = 6.8, 3.2 Hz, 1H), 3.27-3.17 (m, 1H), 1.35-1.32 (m, 5H), 1.27 (t, J = 7.0 Hz,3H), 1.20-1.17 (m, 3H), 0.98-0.90 (m, 3H); ESI MS(m/z):356.95[M+1].
292	1-((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)六氢-λ⁶-噻喃 1-氧化物 (1-((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)hexahydro-λ⁶-thiopyran 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.91 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.62-7.60 (m, 1H), 7.58 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.17 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.38 (t, J = 6.7 Hz, 2H), 3.27-3.19 (m, 2H), 1.90 (q, J = 5.5 Hz, 4H), 1.64-1.55 (m, 2H); ESI MS(m/z):326.9 [M+1].
293	叔丁基((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (d, J = 1.2

[0576]

	吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 (tert-butyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	Hz, 1H), 8.97 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.42 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.16 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.01 (s, 3H), 1.43 (s, 9H) ESI MS(m/z):346.9[M+1].
294	异戊基(异丙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (isopentyl(isopropyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.97 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.18 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 7.05 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.54 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 3.26-3.23 (m, 2H), 1.65-1.52 (m,3H), 1.37 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.21 (q, J = 3.3 Hz, 3H), 0.84 (dd, J = 7.8, 6.3 Hz, 6H) ESI MS(m/z):371.95[M+1].
295	乙基(甲基)((2-(吡啶-3-基)-7-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-7-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 9.14 (s, 1H), 8.66 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.3, 5.4 Hz, 1H), 7.47 (s, 1H), 7.33 (s, 1H), 3.41 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.17 (s, 3H), 1.31 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):369[M+1].
296	二乙基((2-(吡啶-3-基)-7-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(pyridin-3-yl)-7-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.13 (s, 1H), 8.66 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.47 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.35 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 3.36 (q, J = 7.4 Hz, 4H), 1.27 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):383[M+1].
297	乙基(甲基)((2-(嘧啶-5-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(methyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (s, 2H), 9.28 (s, 1H), 9.13 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.46 (s, 1H), 3.40 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 3.14 (s, 3H), 1.30 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):369.9[M+1].
298	乙基(甲基)((2-(吡啶-3-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.29 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.07 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.66 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.5, 1.3 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.67-7.63 (m, 1H), 7.46 (s, 1H), 3.39 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.13 (s, 3H), 1.31 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):368.85[M+1].
299	4-((2-(吡啶-3-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-1,4λ⁶-氧硫杂环己烷 4-氧化物 (4-((2-(pyridin-3-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-1,4λ⁶-oxathiane 4-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.29 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.08 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.65 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 7.47 (s, 1H), 4.11-4.07 (m, 2H), 3.84 (t, J = 10.4 Hz, 2H), 3.63 (d, J = 13.1 Hz, 2H), 3.49-3.42 (m, 2H); ESI MS(m/z):396.9[M+1].
300	乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.22 (s, 1H), 9.11 (s, 1H), 8.70 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.47 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.44 (s, 1H), 3.40 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.14 (s, 3H), 1.30 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):386.85[M+1].

[0577]

301	((2-(5-氟吡啶-3-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(2-甲氧基乙基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)(2-methoxyethyl)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.22 (s, 1H), 9.12 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.47 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.45 (s, 1H), 3.80-3.62 (m, 4H), 3.27 (s, 3H), 3.18 (s, 3H); ESI MS(m/z):416.9[M+1].
302	4-((2-(5-氟吡啶-3-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-1,4λ⁶-氧硫杂环己烷 4-氧化物 (4-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-1,4λ⁶-oxathiane 4-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.22 (s, 1H), 9.12 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.49-8.45 (m, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.45 (s, 1H), 4.11-4.08 (m, 2H), 3.84 (t, J = 10.4 Hz, 2H), 3.64 (d, J = 13.7 Hz, 2H), 3.50-3.43 (m, 2H); ESI MS(m/z):414.9[M+1].
303	1-((2-(5-氟吡啶-3-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.22 (s, 1H), 9.13 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.47 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.36 (s, 1H), 3.37 (q, J = 6.6 Hz, 2H), 3.29-3.24 (m, 2H), 2.26-2.19 (m, 2H), 2.11-2.05 (m, 2H) ESI MS(m/z):398.9[M+1].
304	1-((3-甲基-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((3-methyl-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.90 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.13 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.06 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.36 (q, J = 6.5 Hz, 2H), 3.26-3.20 (m, 2H), 2.60 (s, 3H), 2.24-2.10 (m, 4H) ESI MS(m/z):327.00[M+1].
305	二丙基((2-(嘧啶-5-基)-6-(三氟甲基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (dipropyl((2-(pyrimidin-5-yl)-6-(trifluoromethyl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (s, 2H), 9.27 (s, 1H), 9.11 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.45 (s, 1H), 3.34-3.32 (m, 4H), 1.79-1.71 (m, 4H), 0.96 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS(m/z):411.9[M+1].
306	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)二甲基-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)dimethyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (s, 1H), 9.07 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.44 (s, 6H); ESI MS (m/z):305.75[M+1].
307	乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (s, 1H), 9.06 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.60 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 3.36 (s, 3H), 1.31 (t, J = 7.5 Hz, 3H);p ESI MS (m/z):319.80[M+1].
308	二乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(5-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (s, 1H), 9.05 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H),

[0578]

	fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	6.81 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.58 (q, J = 7.3 Hz, 4H), 1.28 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS (m/z):333.85[M+1].
309	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)(甲基)(丙基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)(methyl)(propyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (s, 1H), 9.07 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.61-3.53 (m, 2H), 3.38 (s, 3H), 1.85-1.73 (m, 2H), 1.00 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z):333.80[M+1].
310	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)二丙基-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)dipropyl-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (s, 1H), 9.07 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.42 (dt, J = 10.3, 2.3 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.59-3.50 (m, 4H), 1.85-1.69 (m, 4H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS (m/z):362.20[M+1].
311	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)(异丙基)(甲基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)(isopropyl)(methyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (s, 1H), 9.07 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.37 (d, J = 8.8 Hz, 3H), 1.45-1.37 (m, 6H); ESI MS (m/z):333.80[M+1].
312	乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)(异丙基)-λ^6-硫烷酮 (ethyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)(isopropyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (s, 1H), 9.06 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.3, 2.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.93-3.87 (m, 1H), 3.69-3.59 (m, 2H), 1.37 (dd, J = 9.3, 6.8 Hz, 6H), 1.28 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):348.00[M+1].
313	叔丁基((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)(甲基)-λ^6-硫烷酮 (tert-butyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)(methyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (s, 1H), 9.08 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.42 (dt, J = 10.2, 2.4 Hz, 1H), 7.95-7.92 (m, 1H), 6.80 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.46 (s, 3H), 1.46 (s, 9H); ESI MS (m/z):347.85[M+1].
314	乙基(甲基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (ethyl(methyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.08 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.61 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 3.37 (s, 3H), 1.31 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):302.80[M+1].
315	异丙基(丙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (isopropyl(propyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.20 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 9.08 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.96 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.97-3.90 (m, 1H), 3.63-3.50 (m, 2H), 1.87-1.68 (m, 2H), 1.37 (dd, J = 8.6, 6.8 Hz, 6H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z):344.85[M+1].
316	二异丙基((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.20

[0579]

	唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diisopropyl((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	(s, 1H), 9.05 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.97-3.91 (m, 2H), 1.40 (dd, J = 16.4, 6.8 Hz, 12H); ESI MS (m/z):344.85[M+1].
317	叔丁基(甲基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (tert-butyl(methyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.10 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.46 (s, 3H), 1.46 (s, 9H) ESI MS (m/z):330.85[M+1].
318	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)(2-甲氧基乙基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)(2-methoxyethyl)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (s, 1H), 9.08 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.42 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.99-3.83 (m, 2H), 3.82-3.75 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 3.33 (s, 3H); ESI MS (m/z):349.80[M+1].
493	(环丁基甲基)(异丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclobutylmethyl)(isopropyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.91 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.1, 5.0 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.45-3.35 (m, 3H), 2.81-2.77 (m, 1H), 2.04 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 1.84-1.72 (m, 5H), 1.33 (dd, J = 26.6, 6.7 Hz, 7H) ESI MS (m/z): 368.95 [M+1]
494	仲丁基(异丙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (sec-butyl(isopropyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.46 (d, J = 2.1 Hz, 2H), 9.20 (s, 1H), 8.95 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.19 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.10 (dt, J = 9.3, 2.4 Hz, 1H), 3.65-3.59 (m, 1H), 3.38 (tt, J = 10.2, 3.5 Hz, 1H), 2.07-2.00 (m, 1H), 1.35-1.32 (m, 5H), 1.29-1.22 (m, 5H), 0.94 (dt, J = 16.5, 7.5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 357.9 [M+1]
495	(环丁基甲基)(异丙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclobutylmethyl)(isopropyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.97 (s, 1H), 7.57 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.42 (dt, J = 18.8, 6.7 Hz, 3H), 2.79 (s, 1H), 2.05 (d, J = 7.6 Hz, 2H), 1.84-1.73 (m, 4H), 1.33 (dd, J = 26.6, 6.7 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 369.9 [M+1].
496	*仲丁基((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮 (sec-butyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)*	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.18 (s, 1H), 8.93 (s, 1H), 8.62 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.40 (dt, J = 10.2, 2.4 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.09 (dt, J = 9.2, 2.3 Hz, 1H), 3.65-3.58 (m, 1H), 3.38 (qd, J = 6.8, 3.4 Hz, 1H), 2.06-2.00 (m, 1H), 1.56-1.37 (m, 1H), 1.35-1.32 (m, 4H), 1.27 (t, J = 7.0 Hz, 5H), 0.94 (dt, J = 16.2, 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 375.1 [M+1]

[0580]

497	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(异戊基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮 (sec-butyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (s, 1H), 8.95 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.62 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.58-3.51 (m, 1H), 3.26-3.22 (m, 2H), 1.63-1.59 (m, 2H), 1.34 (dd, J = 26.9, 6.7 Hz, 6H), 0.84 (dd, J = 7.8, 6.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 389.1 [M+1]
498	(环丁基甲基)((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclobutylmethyl)((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (s, 1H), 8.95 (s, 1H), 8.62 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.14 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.41 (dt, J = 19.4, 6.7 Hz, 3H), 2.79 (t, J = 8.1 Hz, 1H), 2.04 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 1.84-1.72 (m, 4H), 1.39-1.29 (m, 6H) ESI MS (m/z): 386.95 [M+1].
499	1-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)六氢-λ⁶-噻喃 1-氧化物 (1-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)hexahydro-λ⁶-thiopyran 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (s, 1H), 8.96 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.42 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.15 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.40-3.37 (m, 2H), 3.27-3.20 (m, 2H), 1.93-1.88 (m, 4H), 1.66-1.54 (m, 2H); ESI MS (m/z): 344.95 [M+1].
500	1-((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.09 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 9.04 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.68 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 2H), 3.34 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 3.30 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 2.23-2.16 (m, 2H), 2.14-2.07 (m, 2H); ESI MS (m/z): 314.1 [M+1].
501	4-((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)-1,4 λ⁶-氧硫杂环己烷 4-氧化物 (4-((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)-1,4 λ⁶-oxathiane 4-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.05 (s, 2H), 8.68 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 6.90 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 4.07 (qd, J = 6.3, 3.2 Hz, 2H), 3.99-3.93 (m, 2H), 3.72 (dt, J = 14.6, 3.1 Hz, 2H), 3.55-3.49 (m, 2H); ESI MS (m/z): 330.05 [M+1]
502	二乙基((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.03 (d, J = 13.0 Hz, 2H), 8.68 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.3, 4.6 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 3.52-3.41 (m, 4H), 1.27 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 315.9 [M+1]
503	1-((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.29 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 9.12 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 9.10 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 2H), 3.35 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 3.29 (s, 1H), 2.24-2.16 (m, 2H), 2.14-2.05 (m, 2H) ESI MS (m/z): 314.95 [M+1]
504	4-((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-1,4 λ⁶-氧硫杂环己烷 4-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.91 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.60 (dd,

[0581]

	氧化物 (4-((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-1,4 λ^6-oxathiane 4-oxide)	J = 8.1, 5.0 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 4.1-4.05 (m, 2H), 3.98-3.90 (m, 2H), 3.52-3.45 (m, 2H), 3.41-3.32 (m, 2H); ESI MS (m/z): 329 [M+1]
505	异丙基((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(吡啶-4-基甲基)-λ^6-硫烷酮 (isopropyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(pyridin-4-ylmethyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.93 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.53 (dd, J = 4.3, 1.5 Hz, 2H), 8.42 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.61 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.40-7.38 (m, 2H), 7.19 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 4.73 (q, J = 13.6 Hz, 1H), 3.37 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 2.53 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 1.40 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.34 (d, J = 7.0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 392.05 [M+1].
506	异丙基(吡啶-2-基甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (isopropyl(pyridin-2-ylmethyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.95 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.58 (ddd, J = 17.7, 4.6, 1.2 Hz, 2H), 8.42 (t, J = 1.4 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.61 (q, J = 4.4 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.36-7.30 (m, 2H), 7.24 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 4.78 (dd, J = 31.5, 14.1 Hz, 2H), 3.50 (s, 1H), 1.43 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.38 (d, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 392 [M+1]
507	乙基((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(吡啶-4-基)-λ^6-硫烷酮 (ethyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(pyridin-4-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.87-8.86 (m, 3H), 8.58 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.35 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.86 (dd, J = 4.3, 1.5 Hz, 2H), 7.60-7.54 (m, 2H), 7.05-7.02 (m, 2H), 3.63 (td, J = 7.6, 7.0 Hz, 2H), 1.20 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):364.05 [M+1]
508	4-((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-1,4 λ^6-氧硫杂环己烷 4-氧化物 (4-((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-1,4 λ^6-oxathiane 4-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.97 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.19 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 4.1-4.02 (m, 2H), 3.98-3.88 (m, 2H), 3.52-3.45 (m, 2H), 3.44-3.34 (m, 2H). ESI MS (m/z): 330 [M+1].
509	(3-甲氧基苯基)(甲基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 ((3-methoxyphenyl)(methyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47-9.41 (m, 2H), 9.18 (d, J = 10.1 Hz, 1H), 8.91 (s, 1H), 7.56-7.44 (m, 4H), 7.38-7.19 (m, 1H), 7.09-7.00 (m, 2H), 3.79-3.76 (m, 3H), 3.42 (s, 3H) ESI MS (m/z): 379.95 [M+1]
510	甲基(吡啶-2-基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (methyl(pyridin-2-yl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.95 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.58 (ddd, J = 17.7, 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.42 (t, J = 1.4 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.61 (q, J = 4.4 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.36-7.30 (m, 2H), 7.24 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.50 (s, 3H) ESI MS (m/z): 350.9 [M+1]
511	乙基(吡啶-4-基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (ethyl(pyridin-4-yl)((2-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.87-8.86 (m, 2H), 8.58 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.35 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.86 (dd, J =

	(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	4.3, 1.5 Hz, 2H), 7.60-7.54 (m, 2H), 7.05-7.02 (m, 2H), 3.63 (td, J = 7.6, 7.0 Hz, 2H), 1.20 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):364.95 [M+1]
512	(环丙基甲基)(异丙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclopropylmethyl)(isopropyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 8.97 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.19 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.57 (t, J = 6.9 Hz, 1H), 3.28 (d, J = 6.7 Hz, 2H), 1.39 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.33 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 1.04 (s, 1H), 0.56-0.54 (m, 2H), 0.30 (dd, J = 4.9, 3.1 Hz, 2H); ESI MS (m/z):356 [M+1].
513	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(3-甲氧基苯基)(甲基)-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(3-methoxyphenyl)(methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.13 (s, 1H), 8.89 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.35 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.54-7.51 (m, 3H), 7.44 (t, J = 1.4 Hz, 1H), 7.21 (td, J = 4.7, 2.6 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 6.98 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 3.80 (d, J = 5.5 Hz, 3H), 3.42 (s, 3H); ESI MS (m/z): 396.95 [M+1]
514	(2-甲氧基乙基)(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((2-methoxyethyl)(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.04 (dd, J = 12.1, 0.8 Hz, 2H), 8.68 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 6.84 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.86-3.74 (m, 4H), 3.28 (d, J = 1.5 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 331.9 [M+1]
[0582] 515	1-((3-甲基-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)六氢-λ⁶-噻喃 1-氧化物 (1-((3-methyl-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)hexahydro-λ⁶-thiopyran 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.89 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.12 (dq, J = 8.1, 1.3 Hz, 1H), 7.66-7.62 (m, 1H), 7.48 (dd, J = 9.0, 0.7 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.02 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.38-3.34 (m, 2H), 3.25-3.18 (m, 2H), 2.59 (s, 3H), 1.91-1.87 (m, 4H), 1.65-1.54 (m, 2H); ESI MS (m/z): 341.0 [M+1]
516	4-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)-1,4 λ⁶-氧硫杂环己烷 4-氧化物 (4-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)-1,4 λ⁶-oxathiane 4-oxide)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.11 (s, 1H), 9.05-8.98 (m, 1H), 8.58 (dd, J = 6.4, 2.4 Hz, 1H), 8.35 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.11 (dt, J = 9.0, 2.4 Hz, 1H), 7.01 (s, 1H), 4.27-4.15 (m, 4H), 3.77 (dt, J = 14.7, 2.8 Hz, 2H), 3.54-3.48 (m, 2H) ESI MS (m/z): 347.9 [M+1]
517	乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-3-甲基-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-3-methyl-2H-indazol-5-yl)imino)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.83 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.20 (dt, J = 9.5, 2.3 Hz, 1H), 7.46 (dd, J = 9.0, 0.7 Hz, 1H), 7.11 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.04 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 2H), 3.33-3.24 (m, 2H), 2.62 (s, 3H), 1.37 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 1.31 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.24 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 360.95 [M+1]
518	1-((2-(5-氟吡啶-3-基)-3-甲基-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-3-methyl-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 8.73 (s, 1H), 8.59 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.78 (dt, J = 8.7, 2.3 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.0, 0.7 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.15 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.62-3.53 (m, 2H), 3.25-3.18 (m, 2H), 2.69 (s, 3H), 2.42-2.28

[0583]

	1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	(m, 4H); ESI MS (m/z): 344.9 [M+1].
519	1-((2-(5-氟吡啶-3-基)-3-甲基-2H-吲唑-5-基)亚胺基)六氢-λ⁶-噻喃 1-氧化物 (1-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-3-methyl-2H-indazol-5-yl)imino)hexahydro-λ⁶-thiopyran 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.82 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.20 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.10 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.03 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.42-3.33 (m, 2H), 3.26-3.19 (m, 2H), 2.63 (s, 3H), 1.92-1.88 (m, 4H), 1.64-1.57 (m, 2H); ESI MS (m/z): 358.9 [M+1]
520	二乙基((2-(5-氟吡啶-3-基)-3-甲基-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (diethyl((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-3-methyl-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.83 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.20 (dt, J = 9.7, 2.3 Hz, 1H), 7.47 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.10 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.35-3.32 (m, 1H), 3.31-3.25 (m, 3H), 2.62 (s, 3H), 1.25 (t, J = 7.5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 346.95 [M+1]
521	4-((3-甲基-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-1,4 λ⁶-氧硫杂环己烷 4-氧化物 (4-((3-methyl-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-1,4 λ⁶-oxathiane 4-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.89 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.12 (dq, J = 8.2, 1.3 Hz, 1H), 7.66-7.59 (m, 1H), 7.50 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 7.08-7.03 (m, 1H), 4.10-4.02 (m, 2H), 3.98-3.92 (m, 2H), 3.49-3.45 (m, 2H), 3.40-3.34 (m, 2H), 2.60 (s, 3H) ESI MS (m/z): 342.95 [M+1]
522	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)(异丙基)(2-甲氧基乙基)-λ⁶-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)(isopropyl)(2-methoxyethyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (s, 1H), 9.07 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.0, 0.7 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 4.08-4.02 (m, 1H), 3.93-3.86 (m, 1H), 3.82-3.73 (m, 2H), 3.72-3.63 (m, 1H), 3.25 (d, J = 12.2 Hz, 3H), 1.45-1.37 (m, 6H) ESI MS (m/z): 378.1 [M+1]
523	(环丙基甲基)((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclopropylmethyl)((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (s, 1H), 9.06 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.40 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.95-7.93 (m, 1H), 6.82 (q, J = 4.6 Hz, 1H), 3.85-3.78 (m, 1H), 3.71 (dq, J = 25.5, 7.2 Hz, 2H), 1.39 (dd, J = 8.1, 6.8 Hz, 6H), 1.10-1.04 (m, 1H), 0.64-0.54 (m, 2H), 0.41-0.28 (m, 2H) ESI MS (m/z): 374.00 [M+1]
524	1-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (s, 1H), 9.10 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.43 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.3, 0.7 Hz, 1H), 6.84 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.67-3.60 (m, 2H), 3.36 (q, J = 6.8 Hz, 2H), 2.26-2.19 (m, 2H), 2.15-2.06 (m, 2H); ESI MS (m/z): 331.85 [M+1]
525	1-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)六氢-λ⁶-噻喃 1-氧化物 (1-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)hexahydro-λ⁶-thiopyran 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (s, 1H), 9.04 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.40 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.83 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.74 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 3.50-3.43 (m, 2H), 1.99-1.86 (m, 4H), 1.63-1.58 (m, 2H); ESI MS (m/z): 345.95 [M+1]

[0584]

526	4-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-1,4 λ^6-氧硫杂环己烷 4-氧化物 (4-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-1,4 λ^6-oxathiane 4-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (s, 1H), 9.08 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.1, 2.4 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.11 (ddd, J = 12.6, 5.7, 3.3 Hz, 2H), 3.96-3.86 (m, 4H), 3.60-3.54 (m, 2H); ESI MS (m/z): 347.95 [M+1]
527	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)(异丙基)(吡啶-2-基甲基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)(isopropyl)(pyridin-2-ylmethyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.23 (s, 1H), 9.17 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.65 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.59-8.58 (m, 1H), 8.45 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.76 (td, J = 7.7, 1.8 Hz, 1H), 7.38-7.33 (m, 2H), 6.77 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 5.26 (s, 2H), 3.66 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 1.43 (dd, J = 15.6, 6.8 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 410.95 [M+1]
528	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)(异丙基)(吡啶-3-基甲基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)(isopropyl)(pyridin-3-ylmethyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (s, 1H), 9.12 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.56-8.54 (m, 2H), 8.43 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.42 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 5.13 (d, J = 13.7 Hz, 1H), 5.05 (d, J = 13.9 Hz, 1H), 3.77 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 1.41 (dd, J = 18.6, 6.8 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 411.0 [M+1]
529	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)(异丙基)(吡啶-4-基甲基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)(isopropyl)(pyridin-4-ylmethyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.22 (s, 1H), 9.13 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.58 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 8.46-8.42 (m, 1H), 7.99 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.43-7.42 (m, 2H), 6.83 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 5.15 (d, J = 13.4 Hz, 1H), 5.08 (d, J = 13.4 Hz, 1H), 3.69 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 1.40 (dd, J = 14.8, 6.7 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 411.00 [M+1]
530	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)(3-甲氧基苯基)(甲基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)(3-methoxyphenyl)(methyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.16 (s, 1H), 8.98 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.39 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.58-7.52 (m, 2H), 7.51 (t, J = 1.5 Hz, 1H), 7.25 (td, J = 4.7, 2.4 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.83-3.81 (m, 3H), 3.52 (s, 3H); ESI MS (m/z): 397.95 [M+1]
531	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)(异丙基)(丙基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)(isopropyl)(propyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (s, 1H), 9.05 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.41 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.96-3.89 (m, 1H), 3.64-3.49 (m, 2H), 1.84-1.69 (m, 2H), 1.37 (dd, J = 8.2, 7.0 Hz, 6H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 362.00 [M+1]
532	(环丁基甲基)((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)(异丙基)-λ^6-硫烷酮 ((cyclobutylmethyl)((2-(5-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (s, 1H), 9.06 (s, 1H), 8.63 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.41 (d, J = 10.3 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.81-3.71 (m, 3H), 2.73-2.94 (1H), 1.96-2.20 (2H), 1.87-1.85 (m, 4H), 1.35 (dd, J = 6.8, 5.1

[0585]

	fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)(isopropyl)-λ^6-sulfanone)	Hz, 6H); ESI MS (m/z): 388.00 [M+1]
533	4-((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)亚胺基)-1,4 λ^6-氧硫杂环己烷 4-氧化物 (4-((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)imino)-1,4 λ^6-oxathiane 4-oxide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.30 (s, 1H), 9.11 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.09 (t, J = 1.2 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 4.08 (qd, J = 6.3, 3.2 Hz, 2H), 4.00-3.94 (m, 2H), 3.72 (dt, J = 14.8, 3.1 Hz, 2H), 3.56-3.50 (m, 2H) ESI MS (m/z): 330.9[M+1].
534	((2-(5-氟吡啶-3-基)-3-甲基-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(异丙基)(甲基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-3-methyl-2H-indazol-5-yl)imino)(isopropyl)(methyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.83 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.21 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.54-3.47 (m, 1H), 3.01 (s, 3H), 2.63 (s, 3H), 1.40 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.35 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 346.90 [M+1].
535	((2-(5-氟吡啶-3-基)-3-甲基-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)(丙基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-3-methyl-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)(propyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.83 (t, J = 1.3 Hz, 1H), 8.75 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.21 (dt, J = 9.5, 2.3 Hz, 1H), 7.47 (dd, J = 9.0, 0.7 Hz, 1H), 7.09 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.40-3.33 (m, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.64 (s, 3H), 1.83-1.74 (m, 2H), 0.98 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 346.90[M+1].
536	((2-(5-氟吡啶-3-基)-3-甲基-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二甲基-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-3-methyl-2H-indazol-5-yl)imino)dimethyl-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.83 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.75 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.21 (dt, J = 9.6, 2.3 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.09 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.22 (s, 6H), 2.63 (s, 3H); ESI MS (m/z): 318.90[M+1].
537	叔丁基(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (tert-butyl(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.28 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 9.05 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.60 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.95-7.92 (m, 1H), 7.61 (dd, J = 8.4, 4.7 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.45 (s, 3H), 1.44 (d, J = 14.4 Hz, 9H); ESI MS (m/z): 330.1 [M+1].
538	((6-氯吡啶-3-基)甲基)(异丙基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (((6-chloropyridin-3-yl)methyl)(isopropyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.29 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.06 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.61 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.45-8.41 (m, 2H), 7.99 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.3, 2.4 Hz, 1H), 7.63-7.60 (m, 1H), 7.58 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 5.11 (d, J = 13.8 Hz, 1H), 5.03 (d, J = 13.8 Hz, 1H), 3.85-3.79 (m, 1H), 1.41 (dd, J = 12.4, 6.9 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 427 [M+1].
539	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(异丙基)(吡啶-4-基甲基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(isopropyl)(pyridin-4-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (s, 1H), 8.96 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.53 (dd, J = 4.5, 1.6 Hz, 2H), 8.42 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.39 (dd, J = 4.5, 1.6 Hz, 2H), 7.17 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 9.3,

[0586]

	ylmethyl)-λ^6-sulfanone)	2.0 Hz, 1H), 4.73 (dd, J = 26.2, 13.7 Hz, 2H), 3.40-3.33 (m, 1H), 1.40 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.34 (d, J = 6.8 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 410 [M+1].
540	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(异丙基)(吡啶-2-基甲基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(isopropyl)(pyridin-2-ylmethyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (s, 1H), 8.99 (s, 1H), 8.63 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.56 (d, J = 4.2 Hz, 1H), 8.43 (dt, J = 10.3, 2.3 Hz, 1H), 7.76 (td, J = 7.7, 1.8 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.36-7.30 (m, 2H), 7.22 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 4.79 (dd, J = 31.8, 13.9 Hz, 2H), 3.50 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 1.43 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.38 (d, J = 6.8 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 410.05 [M+1].
541	甲基(吡啶-2-基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (methyl(pyridin-2-yl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.86 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.76 (dq, J = 4.7, 0.8 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.36 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.13-8.06 (m, 2H), 7.66 (ddd, J = 7.3, 4.6, 1.5 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 8.7, 5.0 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.04 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.47 (s, 3H) ESI MS (m/z): 349.9 [M+1].
542	异丙基((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)(吡啶-4-基甲基)-λ^6-硫烷酮 (isopropyl((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)(pyridin-4-ylmethyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.29 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.09 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.61 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.57 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 2H), 8.43 (dq, J = 8.4, 1.4 Hz, 1H), 7.99 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.63-7.60 (m, 1H), 7.42 (dd, J = 4.3, 1.5 Hz, 2H), 6.81 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 5.11 (dd, J = 29.5, 13.6 Hz, 2H), 3.73-3.66 (m, 1H), 1.40 (dd, J = 15.1, 6.9 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 392.95 [M+1].
543	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(丙基)(吡啶-2-基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(propyl)(pyridin-2-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.14 (s, 1H), 8.89 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.76 (dq, J = 4.6, 0.8 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.36 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 8.14-8.06 (m, 2H), 7.65 (ddd, J = 7.3, 4.6, 1.5 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.01 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 9.0, 2.0 Hz, 1H), 3.66-3.60 (m, 2H), 1.80-1.71 (m, 1H), 1.66-1.56 (m, 1H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 396 [M+1].
544	异丙基(吡啶-2-基甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ^6-硫烷酮 (isopropyl(pyridin-2-ylmethyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.30 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.13 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.61 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.58 (td, J = 2.9, 1.9 Hz, 1H), 8.44 (dq, J = 8.5, 1.4 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.2, 0.6 Hz, 1H), 7.76 (td, J = 7.8, 1.8 Hz, 1H), 7.64-7.60 (m, 1H), 7.35 (dd, J = 7.6, 4.9 Hz, 2H), 6.76 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 5.24 (d, J = 14.4 Hz, 2H), 3.69-3.62 (m, 1H), 1.47-1.40 (m, 6H) ESI MS (m/z): 393.05 [M+1].
545	((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(甲基)(吡啶-2-基)-λ^6-硫烷酮 (((2-(5-fluoropyridin-3-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.14 (s, 1H), 8.90 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.76 (dq, J = 4.7, 0.8 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.37 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 8.14-8.06 (m, 2H), 7.66 (ddd, J = 7.3, 4.6, 1.5

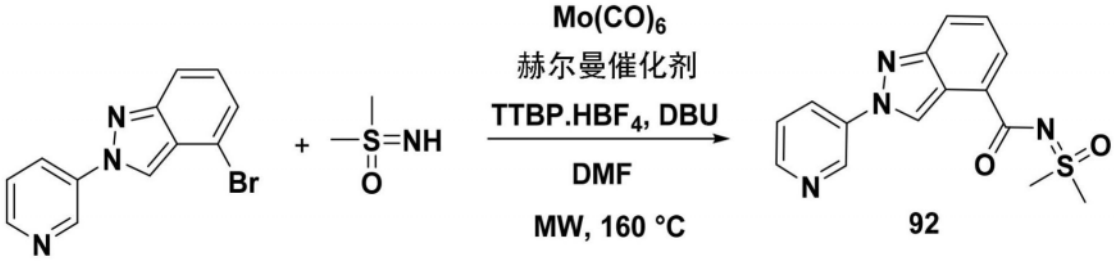
[0587]

	yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(methyl)(pyridin-2-yl)-λ⁶-sulfanone)	Hz, 1H), 7.50 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.02 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.47 (s, 3H) ESI MS (m/z): 367.95 [M+1].
546	(3-甲氧基苯基)(甲基)((2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((3-methoxyphenyl)(methyl)((2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.85 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.58 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.35 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.58 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 7.54-7.49 (m, 3H), 7.44 (s, 1H), 7.21 (td, J = 4.6, 2.9 Hz, 1H), 7.04-7.00 (m, 2H), 3.81-3.74 (m, 3H), 3.40 (d, J = 9.5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 378.9 [M+1].
547	异戊基(异丙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (isopentyl(isopropyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.06 (s, 1H), 7.96 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.93-3.86 (m, 1H), 3.65-3.60 (m, 2H), 1.73-1.62 (m, 2H), 1.59-1.51 (m, 1H), 1.39-1.34 (m, 6H), 0.87 (t, J = 6.0 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 373.00 [M+1].
548	异丙基(2-甲氧基乙基)((2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (isopropyl(2-methoxyethyl)((2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.49-9.45 (m, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.08 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.3, 0.8 Hz, 1H), 6.84 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 4.08-4.02 (m, 1H), 3.93-3.86 (m, 1H), 3.82-3.65 (m, 3H), 3.26 (s, 3H), 1.39 (dd, J = 8.6, 7.0 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 361.05[M+1].
549	((4-氯-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二乙基-λ⁶-硫烷酮 (((4-chloro-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)diethyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.06 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.63 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.62 (qd, J = 4.3, 0.6 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 8.9, 0.9 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 3.35 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 3.30-3.25 (m, 3H), 1.29 (t, J = 7.3 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 348.85[M+1].
550	((4-氯-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(乙基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮 (((4-chloro-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(ethyl)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.04 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.62 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.4, 1.4 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 8.3, 4.9, 0.6 Hz, 1H), 7.55 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.39-7.36 (m, 1H), 3.56-3.49 (m, 1H), 3.28-3.24 (m, 2H), 1.40 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.32 (d, J = 7.0 Hz, 3H), 1.29-1.22 (m, 3H); ESI MS (m/z): 362.90 [M+1].
551	1-((4-氯-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)四氢-1H-λ⁶-噻吩 1-氧化物 (1-((4-chloro-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)tetrahydro-1H-λ⁶-thiophene 1-oxide)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.36-9.34 (m, 2H), 9.26 (s, 1H), 8.43 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.0, 1.0 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.60-3.54 (m, 2H), 3.24-3.19 (m, 2H), 2.43-2.37 (m, 4H); ESI MS (m/z): 347.90 [M+1].
552	((4-氯-2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)二乙基-λ⁶-硫烷酮 (((4-chloro-2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)diethyl-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 9.11 (s, 1H), 8.66 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.52 (dt, J = 10.1, 2.3 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 3.35 (t, J = 7.1 Hz, 2H), 3.28 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 1.29 (t, J = 7.5 Hz, 6H)

[0588]

		ESI MS (m/z): 366.85[M+1].
553	((4-氯-2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)亚胺基)(乙基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮 (((4-chloro-2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)imino)(ethyl)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.02 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.51 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.41-8.38 (m, 1H), 8.10 (dt, J = 9.0, 2.3 Hz, 1H), 7.54-7.46 (m, 2H), 3.53-3.46 (m, 1H), 3.31 (td, J = 14.4, 7.2 Hz, 1H), 3.18 (td, J = 14.4, 7.2 Hz, 1H), 1.56 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 1.50 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.44 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 380.90[M+1].

[0589] 实例2:N-(二甲基(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-羧酰胺(N-(dimethyl(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazole-4-carboxamide)92的合成

[0590] 

[0591] 4-溴-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑(4-bromo-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazole)(0.3g,1.094mmol)、亚胺基二甲基-λ⁶-硫烷酮(iminodimethyl-λ⁶-sulfanone)(0.306g,3.28mmol)的二甲基甲酰胺(dimethyl formamide(DMF))(5mL)溶液以六羰基钼(molybdenum hexacarbonyl(Mo(CO)6))(0.144g,0.547mmol)、四氟硼酸三叔丁基膦(tri-tert-butylphosphine tetrafluoroborate(TTBP.HBF4))(0.016g,0.055mmol)、反式-二(μ-乙酸基)双[氧-(二-o-甲苯基膦)苯甲基]二钯(trans-Di(μ-acetato)bis[o-(di-o-tolylphosphino)benzyl]dipalladium(II))(赫尔曼催化剂(HerrmanN's catalyst))(0.026g,0.027mmol)以及1,8-二氮杂二环[5.4.0]十一碳-7-烯(1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene(DBU))(0.330ml,2.189mmol)处理,并在微波装置(MW)于160℃照射1小时。反应完成后,反应混合物加入水(10mL)淬灭并以乙酸乙酯(2×25mL)萃取。合并的有机层以无水硫酸钠干燥并于减压下浓缩而得到油状剩余物。此剩余物以反相制备级高效管柱层析纯化而得到所需的N-(二甲基(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-羧酰胺(N-(dimethyl(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazole-4-carboxamide)92(220mg,0.700mmol,产率63.9%)。

[0592] 表2:本公开的代表性化合物依据实例2所描述的合适的方法制备。

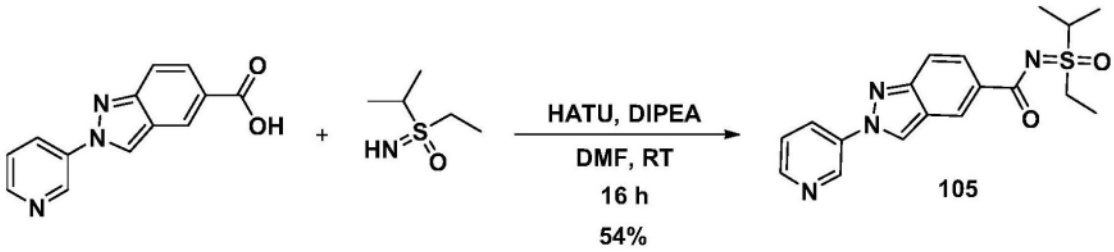
[0593]

化合物编号	化合物名称	分析数据
92	N-(二甲基(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-羧酰胺 (N-(dimethyl(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazole-4-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.37 (d, J = 1.0 Hz, 2H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.55 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.95 (dt, J = 8.6, 0.9 Hz, 1H), 7.88 (dd, J = 7.1, 0.7 Hz, 1H), 7.64 (ddd, J = 8.4, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.43 (dd, J = 8.6, 7.0 Hz, 1H), 3.55 (s, 6H); ESI MS (m/z): 315 [M+1].
225	N-(丁基(乙基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-羧酰胺 (N-(butyl(ethyl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazole-5-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.45 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.55 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.77-7.74 (m, 1H), 3.68-3.52 (m, 4H), 1.83-1.72 (m, 2H), 1.46 (td, J = 14.7, 7.4 Hz, 2H), 1.34 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 0.93 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):372.1 [M+1].

[0594]

226	N-(环己基(甲基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-羧酰胺 (N-(cyclohexyl(methyl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazole-5-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.45 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 7.95 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.58-3.52 (m, 1H), 3.44 (s, 3H), 2.25-2.18 (m, 2H), 1.90 (d, J = 12.5 Hz, 2H), 1.69 (d, J = 13.0 Hz, 1H), 1.60-1.54 (m, 2H), 1.36 (dd, J = 13.0, 3.2 Hz, 2H), 1.23-1.20 (m, 1H); ESI MS(m/z):384.05[M+1].
227	N-(甲基(侧氧基)(丙基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-carboxamide (N-(methyl(oxo)(propyl)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazole-5-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 9.46-9.44 (m, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.54 (t, J = 1.2 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.76-7.74 (m, 1H), 3.65-3.52 (m, 2H), 3.45 (s, 3H), 1.92-1.80 (m, 2H), 1.05 (t, J = 7.5 Hz, 3H) ESI MS(m/z):344.0[M+1].
228	N-(二甲基(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-羧酰胺 (N-(dimethyl(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazole-5-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.45 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.54 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.48 (s, 6H) ESI MS(m/z):316.05[M+1].
230	N-(二异丁基(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-羧酰胺 (N-(diisobutyl(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazole-5-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.46 (s, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 7.94 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 3.62 (dd, J = 14.1, 6.5 Hz, 2H), 3.47 (dd, J = 14.2, 6.4 Hz, 2H), 2.36 (q, J = 6.7 Hz, 2H), 1.08 (q, J = 3.3 Hz, 12H); ESI MS(m/z): 400.1[M+1].
231	N-(二乙基(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-羧酰胺 (N-(diethyl(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazole-5-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.44 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.56 (t, J = 1.2 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.77-7.74 (m, 1H), 3.67-3.56 (m, 4H), 1.34 (t, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS(m/z): 344.0[M+1].

[0595] 实例3:N-(乙基(异丙基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-羧酰胺(N-(ethyl(isopropyl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazole-5-carboxamide)105的合成

[0596] 

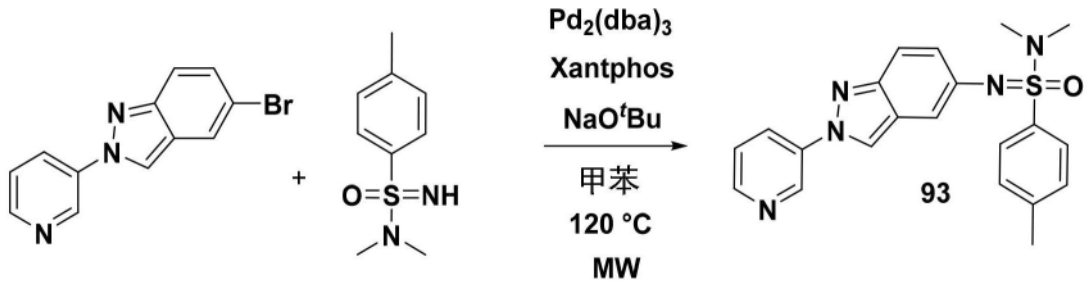
[0597] 2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-羧酸(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazole-5-carboxylic acid)(0.1g,0.418mmol)、乙基(亚胺基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮(ethyl(imino)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)(0.057g,0.418mmol)的二甲基甲酰胺(dimethyl formamide(DMF))(2mL)溶液以1-[双(二甲基胺基)亚甲基]-1H-1,2,3-三唑并[4,5-b]吡啶3-氧化物六氟磷酸盐(1-[Bis(dimethylamino)methylene]-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]pyridinium 3-oxid hexafluorophosphate(HATU))(0.159g,0.418mmol)以及N-乙基-N-(丙-2-基)丙-2-胺(DIPEA)(0.110mL,0.627mmol)处理,并于25℃搅拌16小时。反应完成后,反应混合物藉由加入水(5mL)淬灭并以乙酸乙酯(2×25mL)萃取。合并的有机层以无水硫酸钠干燥并减压浓缩而得到油状剩余物。该剩余物以CombiFlash®层析纯化(普通相;以100%乙酸乙酯等强度(isocratic)运行)而得到所想要的N-(乙基(异丙基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-羧酰胺(N-(ethyl(isopropyl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazole-5-carboxamide)105(80mg,0.224mmol,产率53.7%)。

[0598] 表3:本公开的代表性化合物是依据实例3所描述的合适的起始物与方法制备。

[0599]

化合物编号	化合物名称	分析数据
105	N-(乙基(异丙基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-羧酰胺 (N-(ethyl(isopropyl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazole-5-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.38 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.55 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.93 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.74-7.72 (m, 1H), 7.66 (ddd, J = 8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 3.89-3.82 (m, 1H), 3.74-3.59 (m, 2H), 1.45-1.38 (m, 6H), 1.37-1.27 (m, 4H); ESI MS (m/z):357 [M+1].
106	N-(异丙基(甲基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-羧酰胺 (N-(isopropyl(methyl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazole-5-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.38 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.54 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.48 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.93 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.74 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.66 (ddd, J = 8.4, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 3.79-3.72 (m, 1H), 3.44 (s, 3H), 1.43 (q, J = 3.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z):343[M+1].
107	N-(二乙基(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-羧酰胺 (N-(diethyl(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazole-5-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.38 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.55 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.93 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 7.73 (dt, J = 9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.66 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 3.67-3.55 (m, 4H), 1.34 (t, J = 7.3 Hz, 7H); ESI MS (m/z):343[M+1].

[0600] 实例4:N,N 4-三甲基-N'-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)苯磺酰亚胺酰胺(N,N 4-trimethyl-N'-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)benzenesulfonimidamide)93的合成

[0601] 

[0602] 5-溴-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑(5-bromo-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazole)(0.27g,0.985mmol)、N,N 4-三甲基苯磺酰亚胺酰胺(N,N 4-trimethylbenzenesulfonimidamide)(0.195g,0.985mmol)的甲苯(5mL)溶液以三(二亚苯甲基丙酮)二钯(0)(tris(dibenzylideneacetone)dipalladium(0))($Pd_2(dba)_3$)(0.045g,0.049mmol)、4,5-双(二苯基膦)-9,9-二甲基氧杂蒽(9,9-dimethyl-9H-xanthene-4,5-diyl)bis(diphenylphosphane))(Xantphos)(0.057g,0.098mmol)以及叔丁醇钠(0.095g,0.985mmol)处理,并于120℃在一微波(MW)照射1小时。反应完成后,反应混合物加入水(10mL)而淬灭并以乙酸乙酯(2×25mL)萃取。合并的有机层以无水硫酸钠干燥并且减压浓缩而得到油状剩余物。该剩余物以CombiFlash®层析纯化而得到N,N 4-三甲基-N'-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)苯磺酰亚胺酰胺(N,N 4-trimethyl-N'-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)benzenesulfonimidamide)93(133mg,0.340mmol,产率34.5%)。

[0603] 表4:本公开的代表性化合物依据实例4所描述的合适的起始物与方法制备。

[0604]

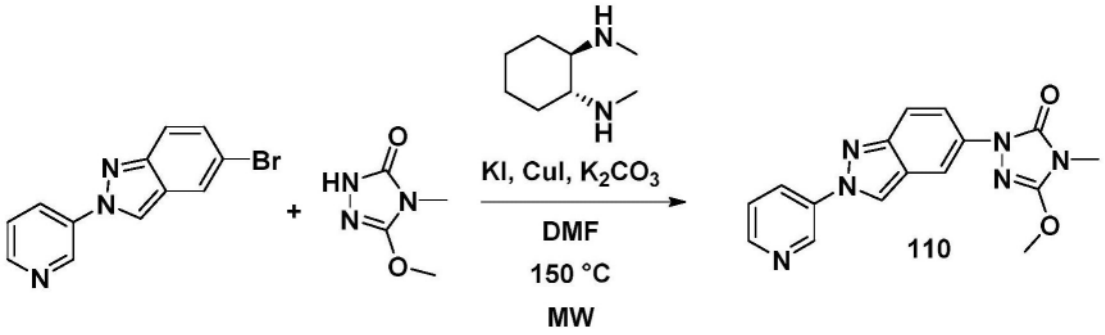
化合物编号	化合物名称	分析数据
93	N, N, 4-三甲基-N'-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)苯磺酰亚胺酰胺 (N, N, 4-trimethyl-N'-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)benzenesulfonimidamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.98 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.61 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.42 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.64-7.60 (m, 2H), 7.47 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.34 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 2.61 (s, 6H), 2.42 (s, 3H) ESI MS (m/z): 392 [M+1].
94	N'-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-N,N,4-三甲基苯磺酰亚胺酰胺 (N'-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-N,N,4-trimethylbenzenesulfonimidamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (s, 1H), 9.03 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.43 (dt, J = 10.1, 2.4 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.63 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.33 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 2.61 (s, 6H), 2.42 (s, 3H); ESI MS (m/z): 410 [M+1].
95	N,N,4-三甲基-N'-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)苯磺酰亚胺酰胺 (N,N,4-trimethyl-N'-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)benzenesulfonimidamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (s, 2H), 9.22 (s, 1H), 9.04 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.65 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.34 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 2.61 (s, 6H), 2.42 (s, 3H) ESI MS (m/z): 393[M+1].
96	N,N,4-三甲基-N'-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)苯磺酰亚胺酰胺 (N,N,4-trimethyl-N'-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)benzenesulfonimidamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.41 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.31 (s, 1H), 8.63 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.55 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.63 (dd, J = 8.4, 4.8 Hz, 1H), 7.49 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.25 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.16 (dd, J = 8.6, 7.1 Hz, 1H), 6.76 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 2.63 (s, 6H), 2.44 (d, J = 7.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 392[M+1].
97	N,N,4-三甲基-N'-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)苯磺酰亚胺酰胺 (N,N,4-trimethyl-N'-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)benzenesulfonimidamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.60 (s, 2H), 9.39 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 7.97 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.49 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.26 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.18 (dd, J = 8.6, 7.1 Hz, 1H), 6.76 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 2.65 (d, J = 10.0 Hz, 6H), 2.45 (d, J = 7.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 393[M+1].
98	N'-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-N,N,4-三甲基苯磺酰亚胺酰胺 (N'-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-N,N,4-trimethylbenzenesulfonimidamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.36 (s, 1H), 9.33 (s, 1H), 8.66 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.58 (dt, J = 10.2, 2.3 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.50 (d, J = 8.1 Hz, 2H), 7.24 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.17 (dd, J = 8.7, 7.0 Hz, 1H), 6.76 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 2.63 (s, 6H), 2.44 (s, 3H); ESI MS (m/z): 410[M+1].
134	N-乙基-N-甲基-N'-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)乙磺酰亚磺酰胺 (N-ethyl-N-methyl-N'-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)ethanesulfonimidamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (s, 2H), 9.22 (s, 1H), 9.15 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.21-7.13 (m, 2H), 6.65 (dd, J = 6.8, 1.0 Hz, 1H), 3.33 (s, 2H), 3.27 (dd, J = 7.2, 5.7 Hz, 2H), 2.81 (s, 3H), 1.39 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 1.01 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z):345.1 [M+1].

[0605]

135	N-乙基-N-甲基-N'-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)环丙磺酰亚磺酰胺 (N-ethyl-N-methyl-N'-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)cyclopropanesulfonimidamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (s, 2H), 9.21 (s, 1H), 9.01 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.59-7.57 (m, 1H), 7.18 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.28-3.20 (m, 3H), 2.81-2.77 (m, 4H), 1.11-0.97 (m, 6H); ESI MS (m/z):356.55 [M+1].

[0606] 实例5:5-甲氧基-4-甲基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮(5-methoxy-4-methyl-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)

[0607] 110的合成

[0608] 

[0609] 在5-溴-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑(5-bromo-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazole)(0.6g,2.189mmol)及5-甲氧基-4-甲基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮(5-methoxy-4-methyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)(0.791g,6.13mmol)的二甲基甲酰胺(DMF)(6mL)溶液中,加入碘化亚铜(CuI)(0.083g,0.438mmol)、反式-1,2-双(甲基胺基)环己烷(trans-1,2-bis(methylamino)cyclohexane)(0.249g,0.876mmol)、碘化钾(KI)(0.109g,0.657mmol)以及碳酸钾(K_2CO_3)(0.908g,6.57mmol),且混合物在微波装置(MW)于150℃照射1小时。反应完成后,反应混合物以加入水(20mL)淬灭并以乙酸乙酯(3×25mL)萃取。合并的有机层以无水硫酸钠干燥并减压浓缩而得到胶状剩余物。该剩余物以CombiFlash®层析纯化而得到5-甲氧基-4-甲基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮(5-methoxy-4-methyl-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)110(0.184g,0.571mmol,产率26.1%)。

[0610] 表5:本公开的代表性化合物依据实例5所描述的合适的起始物与方法制备。

[0611]

化合物编号	化合物名称	分析数据
110	5-甲氧基-4-甲基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-methoxy-4-methyl-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.87-7.84 (m, 1H), 7.77 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.66 (ddd, J = 8.3, 4.7, 0.7 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.04 (s, 3H), 3.01 (s, 3H); ESI MS (m/z): 322.6[M+1].
111	5-甲氧基-4-甲基-2-(2-(5-甲基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-methoxy-4-methyl-2-(2-(5-methylpyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25 (s, 1H), 9.09-9.20 (m,1H), 8.58 (s, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.84 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.02 (d, J = 10.5 Hz, 6H), 2.44 (s, 3H); ESI MS (m/z): 336.7 [M+1].
112	2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-5-甲氧基-4-甲基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.31 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.70 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.52 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.76 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 7.40 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz,

[0612]

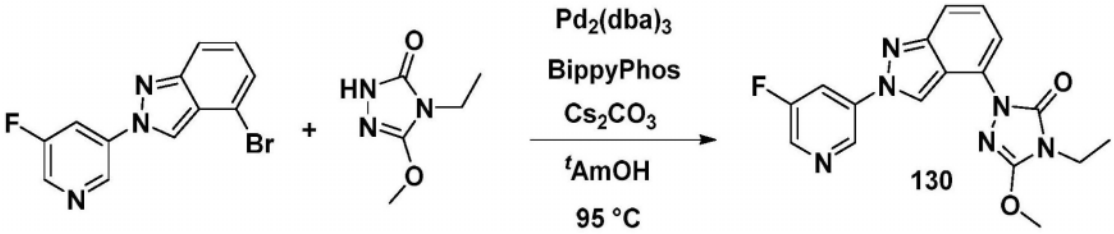
	yl)-5-methoxy-4-methyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H), 3.04 (s, 3H), 3.01 (s, 3H); ESI MS (m/z): 341 [M+1].
113	5-甲氧基-4-甲基-2-(2-(2-甲基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-methoxy-4-methyl-2-(2-(2-methylpyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.84 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 7.9, 1.5 Hz, 1H), 7.85-7.82 (m, 1H), 7.80 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.51-7.48 (m, 1H), 7.36 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.04 (d, J = 5.2 Hz, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.42 (s, 3H); ESI MS (m/z): 336.9 [M+1].
114	5-甲氧基-4-甲基-2-(2-(4-甲基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-methoxy-4-methyl-2-(2-(4-methylpyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.85 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.69 (s, 1H), 8.61 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 7.87-7.83 (m, 1H), 7.80 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.04 (s, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.29 (s, 3H) ESI MS (m/z): 336.9 [M+1].
115	5-甲氧基-4-甲基-2-(2-(6-甲基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-methoxy-4-methyl-2-(2-(6-methylpyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.17 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.36 (dd, J = 8.6, 2.8 Hz, 1H), 7.85-7.83 (m, 1H), 7.75 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.03 (s, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.56 (s, 3H) ESI MS (m/z): 336.9 [M+1].
116	2-(2-(2,6-二甲基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-5-甲氧基-4-甲基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (2-(2-(2,6-dimethylpyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-5-methoxy-4-methyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 8.78 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.84 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 7.82-7.81 (m, 1H), 7.78 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.36-7.31 (m, 2H), 3.04 (d, J = 5.8 Hz, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.55 (s, 3H), 2.36 (s, 3H); ESI MS (m/z): 350.9 [M+1].
117	5-甲氧基-2-(2-(5-甲氧基吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-4-甲基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-methoxy-2-(2-(5-methoxypyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-4-methyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.30 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.94 (s, 1H), 8.40 (s, 1H), 8.07 (t, J = 2.4 Hz, 1H), 7.87-7.84 (m, 1H), 7.76 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.04 (s, 3H), 3.01 (s, 3H) ESI MS (m/z): 353 [M+1].
118	5-甲氧基-4-甲基-2-(2-(5-(三氟甲基)吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-methoxy-4-methyl-2-(2-(5-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.66 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.44 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.07 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.89 (t, J = 1.8 Hz, 1H), 7.88-7.86 (m, 1H), 7.78 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.41 (dd, J = 9.2, 2.1 Hz, 1H), 3.03 (d, J = 5.9 Hz, 3H), 3.01 (s, 3H) ESI MS (m/z): 391 [M+1].
119	5-甲氧基-4-甲基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-methoxy-4-methyl-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.33 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.87 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.79 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.41 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.04 (s, 3H), 3.01 (s, 3H); ESI MS (m/z): 324 [M+1].
120	2-(2-(5-氯吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-5-甲氧基-4-甲基-2,4-二氢-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.99 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.36 (dd, J = 5.9, 1.0 Hz, 1H), 9.11 (d, J =

[0613]

	3H-1,2,4-三唑-3-酮 (2-(2-(5-chloropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-5-methoxy-4-methyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1.0 Hz, 1H), 8.27 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 7.60-7.57 (m, 1H), 7.13 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.37 (dd, J = 10.1, 5.7 Hz, 2H), 3.16 (s, 3H), 1.79-1.72 (m, 2H), 1.38-1.26 (m, 4H), 0.84 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 356.6 [M+1].
121	4-苯甲基-5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-benzyl-5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.20 (s, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.29 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.53-7.48 (m, 3H), 7.38-7.28 (m, 4H), 4.78 (s, 2H), 3.16 (s, 3H); ESI MS (m/z): 399.00 [M+1].
122	4-(2-氟苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(2-fluorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.28 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.87 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 8.1, 4.4 Hz, 1H), 7.41-7.35 (m, 3H), 7.24-7.19 (m, 2H), 4.75 (s, 2H), 3.07 (s, 3H); ESI MS (m/z): 417.15 [M+1].
123	4-乙基-5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-ethyl-5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.35 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.29 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.69 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.89-7.86 (m, 1H), 7.80 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.69-7.66 (m, 1H), 7.39 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.56 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 3.06 (s, 3H), 1.21 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 337.00 [M+1].
124	4-(4-氟苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(4-fluorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.28 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.67 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.87-7.85 (m, 1H), 7.81 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.66 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 7.42-7.36 (m, 3H), 7.22-7.17 (m, 2H), 4.68 (s, 2H), 3.06 (s, 3H); ESI MS (m/z): 417.15 [M+1].

[0614] 实例6:4-乙基-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-5-甲氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮(4-ethyl-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-5-methoxy-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)130的合成

[0615]



[0616] 4-溴-2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑(4-Bromo-2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazole)(300mg,1.027mmol)、4-乙基-5-甲氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮(4-ethyl-5-methoxy-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)(162mg,1.130mmol)、三(二亚苯甲基丙酮)二钯(tris(dibenzylideneacetone)dipalladium(Pd2(dba)3))(103mg,0.113mmol)、5-(二-叔丁基膦)-1',3',5'-三苯基-1'H-[1,4']联吡唑(5-(di-tert-butylphosphino)-1',3',5'-triphenyl-1'H-[1,4']bipyrazole(BippyPhos))(97mg,0.191mmol)以及碳酸铯(Cs_2CO_3)(970mg,2.98mmol)倒入烧瓶,并装设冷凝管,在氮气气氛下,搅拌该反应混合物。加入叔戊醇(Tertiary-amyl alcohol)且反应混合物于氮气气氛下

于95℃加热16小时。反应完成后,反应混合物减压浓缩而得到深色剩余物,其再以CombiFlash®层析纯化而得到4-乙基-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-5-甲氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮(4-ethyl-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-5-methoxy-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)130(132.5mg,0.374mmol,产率36.4%)。

[0617] 表6:本公开的代表性化合物依据实例6所描述的合适的起始物与方法制备。

[0618]

化合物编号	化合物名称	分析数据
125	5-甲氧基-4-甲基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-methoxy-4-methyl-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.29 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 7.3, 0.5 Hz, 1H), 7.65 (ddd, J = 8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.56-7.54 (m, 1H), 7.37 (dd, J = 8.6, 7.3 Hz, 1H), 4.18 (s, 3H), 3.15 (s, 3H); ESI MS (m/z): 322.40 [M+1].
126	4-(3-氟苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(3-fluorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.18 (s, 1H), 8.68 (s, 1H), 8.49 (s, 1H), 8.26 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.34-7.27 (m, 2H), 7.24 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.18 (dd, J = 9.4, 2.1 Hz, 1H), 7.02-6.97 (m, 1H), 4.75 (s, 2H), 3.16-3.14 (m, 3H); ESI MS (m/z): 417.00 [M+1].
127	4-环丙基-5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-cyclopropyl-5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.20 (s, 1H), 8.65 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.46 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.12 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.81 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.4, 4.8 Hz, 1H), 4.05 (d, J = 5.9 Hz, 3H), 2.82-2.77 (m, 1H), 0.97-0.89 (m, 4H); ESI MS (m/z): 349.900[M+1].
128	4-环丙基-5-甲氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-cyclopropyl-5-methoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (s, 2H), 9.36 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.72 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 1H), 4.17 (s, 3H), 2.84 (s, 1H), 0.95 (dd, J = 9.4, 2.8 Hz, 4H) ESI MS (m/z): 350.20 [M+1].
129	4-乙基-5-甲氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-ethyl-5-methoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56 (s, 2H), 9.38 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.29 (s, 1H), 7.74 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.40 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 1H), 4.20 (s, 3H), 3.65 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.24 (t, J = 7.2 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 338.05 [M+1].
130	4-乙基-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-5-甲氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-ethyl-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-5-methoxy-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.34 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.39 (dd, J = 8.8, 7.3 Hz, 1H), 4.20 (s, 3H), 3.65 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 1.24 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 355.20 [M+1].

[0619]

131	4-乙基-5-甲氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-ethyl-5-methoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.52 (s, 2H), 9.27 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.15 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 4.07 (s, 3H), 3.61 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.22 (t, J = 7.2 Hz, 4H) ESI MS (m/z): 338.20 [M+1].
132	4-环丙基-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-5-甲氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-cyclopropyl-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-5-methoxy-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.24 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 8.68 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.49-8.47 (m, 1H), 8.11 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.81 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.80 (s, 1H), 0.95-0.91 (m, 4H) ESI MS (m/z): 367.20 [M+1].
133	4-乙基-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-5-甲氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-ethyl-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-5-methoxy-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25-9.24 (m, 2H), 8.68 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.48 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.13 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.4, 2.1 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 4.07 (s, 3H), 3.61 (q, J = 7.2 Hz, 2H), 1.21 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 355.00 [M+1].
319	2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-5-甲氧基-4-(3-甲基丁-2-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-5-methoxy-4-(3-methylbutan-2-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25 (t, J = 1.3 Hz, 2H), 8.69-8.68 (m, 1H), 8.49 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.14 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.4, 2.1 Hz, 1H), 7.83-7.81 (m, 1H), 4.06 (s, 3H), 3.72 (td, J = 7.0, 2.9 Hz, 1H), 2.17-2.12 (m, 1H), 1.40 (d, J = 7.1 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.80 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 397.10 [M+1].
320	4-环丙基-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-5-甲氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-cyclopropyl-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-5-methoxy-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.31 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.54 (dd, J = 10.0, 2.2 Hz, 1H), 7.69 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 8.8, 7.3 Hz, 1H), 4.17 (s, 3H), 2.84 (s, 1H), 0.96 (d, J = 6.6 Hz, 4H); ESI MS (m/z): 367.05 [M+1].
321	4-环丙基-5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-cyclopropyl-5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.67 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 8.51-8.48 (m, 1H), 7.69 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.4, 4.8 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.38-7.34 (m, 1H), 4.16 (s, 3H), 2.84 (s, 1H), 0.97-0.94 (m, 4H); ESI MS (m/z): 349.05 [M+1].
322	5-甲氧基-4-(3-甲基丁-2-基)-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-methoxy-4-(3-methylbutan-2-yl)-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.21 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.47 (dq, J = 8.5, 1.3 Hz, 1H), 8.15 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 4.06 (s, 3H), 3.72 (dd, J = 9.9, 7.0 Hz, 1H), 2.17-2.12 (m, 1H), 1.40 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 0.97 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 0.80 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 379.25 [M+1].
323	4-环丙基-5-甲氧基-2-(2-(嘧啶-5-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.52 (s, 2H),

[0620]

	基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-cyclopropyl-5-methoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	9.27-9.26 (m, 2H), 8.13 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.81-2.78 (m, 1H), 0.95-0.91 (m, 4H); ESI MS (m/z): 350.20 [M+1].
324	4-乙基-5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-ethyl-5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.34 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.30 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.72-7.70 (m, 1H), 7.65 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 1H), 4.19 (s, 3H), 3.65 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.24 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 337.25 [M+1].
325	2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-5-甲氧基-4-(2,2,2-三氟乙基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-5-methoxy-4-(2,2,2-trifluoroethyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.28 (s, 1H), 9.25 (s, 1H), 8.69 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.49 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.4, 2.1 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 4.50 (q, J = 9.1 Hz, 2H), 4.09 (d, J = 9.8 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 408.60 [M+1].
326	5-乙氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-4-(3-(三氟甲基)苯甲基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-4-(3-(trifluoromethyl)benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.53 (s, 2H), 9.28 (s, 1H), 8.15 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.4, 2.1 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.63 (d, J = 5.1 Hz, 2H), 4.89 (s, 2H), 4.45 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.36 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 1.18-1.29 (1H); ESI MS (m/z): 481.5 [M+1].
327	5-乙氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-4-(3-(三氟甲基)苯甲基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-4-(3-(trifluoromethyl)benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.75-7.71 (m, 3H), 7.66-7.63 (m, 3H), 7.57 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 1H), 4.93 (s, 2H), 4.59 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.1 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 480.55 [M+1].
328	5-乙氧基-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-4-(3-(三氟甲基)苯甲基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-4-(3-(trifluoromethyl)benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.31 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.55-8.52 (m, 1H), 7.73 (t, J = 7.1 Hz, 3H), 7.64 (d, J = 5.6 Hz, 2H), 7.56 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.40 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 1H), 4.93 (s, 2H), 4.60 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.1 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 498.55 [M+1].
329	5-乙氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)-4-(3-(三氟甲基)苯甲基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)-4-(3-(trifluoromethyl)benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (s, 2H), 9.35 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.76-7.71 (m, 3H), 7.65-7.63 (m, 2H), 7.58 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.40 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 1H), 4.93 (s, 2H), 4.61 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.39 (t, J = 7.1 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 482.15 [M+1].
330	5-乙氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-4-(3-(三氟甲基)苯甲基)-2,4-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.22 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.65 (dd, J

[0621]

	二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-4-(3-(trifluoromethyl)benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	= 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.48-8.45 (m, 1H), 8.14 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.73-7.70 (m, 2H), 7.66-7.63 (m, 3H), 4.89 (s, 2H), 4.45 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.36 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 481.05 [M+1].
331	5-乙氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-4-(4-(三氟甲氧基)苯甲基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-4-(4-(trifluoromethoxy)benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.21 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.46 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.14 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.95 (dd, J = 9.5, 2.1 Hz, 1H), 7.84-7.81 (m, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.48-7.45 (m, 2H), 7.39-7.37 (m, 2H), 4.81 (s, 2H), 4.45 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 497.10[M+1].
332	5-乙氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)-4-(4-(三氟甲氧基)苯甲基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)-4-(4-(trifluoromethoxy)benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.52 (s, 2H), 9.28-9.26 (m, 2H), 8.15 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.5, 2.1 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 4.81 (s, 2H), 4.45 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 497.95[M+1].
333	5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-4-(4-(三氟甲氧基)苯甲基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-4-(4-(trifluoromethoxy)benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.31 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 7.3, 0.6 Hz, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.57 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.49-7.47 (m, 2H), 7.40-7.36 (m, 3H), 4.86 (s, 2H), 4.18 (s, 3H) ESI MS (m/z): 482.90[M+1].
334	5-甲氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)-4-(4-(三氟甲氧基)苯甲基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-methoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)-4-(4-(trifluoromethoxy)benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56 (s, 2H), 9.39 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.75 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 9.2, 2.4 Hz, 2H), 7.41-7.37 (m, 3H), 4.87 (s, 2H), 4.19 (s, 3H); ESI MS (m/z): 483.85[M+1].
335	5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-4-(3-(三氟甲基)苯甲基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-4-(3-(trifluoromethyl)benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.22 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.47 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 8.16 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 2.1 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.72-7.69 (m, 2H), 7.66-7.62 (m, 3H), 4.90 (s, 2H), 4.06 (s, 3H) ESI MS (m/z): 467.00[M+1].
336	4-(4-氟苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(4-fluorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.30 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 7.3, 0.6 Hz, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.56 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.42-7.38 (m,

[0622]

	dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	3H), 7.21 (tt, J = 9.3, 2.5 Hz, 2H), 4.81 (s, 2H), 4.18 (s, 3H) ESI MS (m/z): 417.00[M+1].
337	5-乙氧基-4-(4-氟苯甲基)-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-4-(4-fluorobenzyl)-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.21 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.46 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.13 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.64 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 7.41-7.36 (m, 2H), 7.23-7.18 (m, 2H), 4.76 (s, 2H), 4.44 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 431.30[M+1].
338	5-乙氧基-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-4-(4-(三氟甲氧基)苯甲基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-4-(4-(trifluoromethoxy)benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26-9.24 (m, 2H), 8.68 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.49 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.13 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 1.8 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 4.81 (s, 2H), 4.45 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 515.15[M+1].
339	4-(4-氟苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(4-fluorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.05 (q, J = 1.3 Hz, 1H), 9.42-9.41 (m, 2H), 8.34 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 8.15 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 8.01 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.39 (dd, J = 8.8, 5.4 Hz, 2H), 7.22-7.18 (m, 2H), 4.77 (s, 2H), 4.06 (s, 3H); ESI MS (m/z): 418.15[M+1].
340	4-(4-氟苯甲基)-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-5-甲氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(4-fluorobenzyl)-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-5-methoxy-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.35 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.41-7.37 (m, 3H), 7.21 (t, J = 8.9 Hz, 2H), 4.81 (s, 2H), 4.18 (s, 3H); ESI MS (m/z): 435.10[M+1].
341	5-乙氧基-4-(4-氟苯甲基)-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-4-(4-fluorobenzyl)-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.05 (dd, J = 2.9, 1.0 Hz, 1H), 9.42-9.41 (m, 2H), 8.33 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 8.13 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.41-7.37 (m, 2H), 7.23-7.18 (m, 2H), 4.76 (s, 2H), 4.45 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 432.35[M+1].
342	5-乙氧基-4-(4-氟苯甲基)-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-4-(4-fluorobenzyl)-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25-9.24 (m, 2H), 8.68 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.49 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.12 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.41-7.37 (m, 2H), 7.23-7.18 (m, 2H), 4.76 (s, 2H), 4.44 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 449.20[M+1].
343	5-乙氧基-4-(4-氟苯甲基)-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-4-(4-fluorobenzyl)-2-(2-(pyridin-3-yl)-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.26 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.72-7.70 (m, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.56 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.43-7.35 (m, 3H), 7.24-7.19

[0623]

	2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	(m, 2H), 4.80 (s, 2H), 4.58 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 431.25[M+1].
344	5-乙氧基-4-(4-氟苯甲基)-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-4-(4-fluorobenzyl)-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (s, 2H), 9.34 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.74 (dd, J = 7.5, 0.6 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.43-7.38 (m, 3H), 7.24-7.19 (m, 2H), 4.80 (s, 2H), 4.60 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.1 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 432.40[M+1].
345	5-乙氧基-4-(4-氟苯甲基)-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-4-(4-fluorobenzyl)-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.30 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.53 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 7.72-7.70 (m, 1H), 7.56 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.43-7.37 (m, 3H), 7.25-7.19 (m, 2H), 4.80 (s, 2H), 4.59 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 449.04[M+1].
346	2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-5-甲氧基-4-(3-(三氟甲基)苯甲基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-5-methoxy-4-(3-(trifluoromethyl)benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26-9.25 (m, 2H), 8.69 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.49 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.15 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.72-7.69 (m, 2H), 7.65-7.62 (m, 2H), 4.90 (s, 2H), 4.06 (s, 3H); ESI MS (m/z): 485.25[M+1].
347	2-(3-氯-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-5-甲氧基-4-甲基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (2-(3-chloro-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-5-methoxy-4-methyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.00 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.81 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.26 (dq, J = 8.2, 1.3 Hz, 1H), 7.87 (dd, J = 9.3, 0.7 Hz, 1H), 7.72 (ddd, J = 8.2, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.64 (q, J = 1.0 Hz, 1H), 7.47 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.04 (d, J = 4.4 Hz, 3H), 3.01 (s, 3H); ESI MS (m/z): 356.85 [M+1].
348	4-(4-氯苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(4-chlorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.05 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.42-9.41 (m, 2H), 8.34 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 8.15 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.01 (dd, J = 9.5, 2.1 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.45-7.42 (m, 2H), 7.36 (d, J = 8.6 Hz, 2H), 4.78 (s, 2H), 4.05 (s, 3H); ESI MS (m/z): 434.15[M+1].
349	4-(4-氯苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(4-chlorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56 (s, 2H), 9.39 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.75 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.46-7.36 (m, 5H), 4.83 (s, 2H), 4.19 (s, 3H) ESI MS (m/z): 434.20[M+1].
350	4-(4-氯苯甲基)-5-乙氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(4-chlorobenzyl)-5-ethoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (s, 2H), 9.34 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.74 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.42-7.36 (m, 3H), 4.83-4.77 (m, 2H), 4.60 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 447.95[M+1].

[0624]

351	4-(4-氯苯甲基)-5-乙氧基-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(4-chlorobenzyl)-5-ethoxy-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.30 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.53 (dt, J = 10.0, 2.4 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.47-7.44 (m, 2H), 7.41-7.37 (m, 3H), 4.81 (s, 2H), 4.59 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.0 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 464.95[M+1].
352	5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-4-(3-(三氟甲基)苯甲基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-4-(3-(trifluoromethyl)benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.31 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.74-7.70 (m, 3H), 7.66-7.63 (m, 3H), 7.57 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.38 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 1H), 4.94 (s, 2H), 4.18 (s, 3H); ESI MS (m/z): 467.00[M+1].
353	2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-5-甲氧基-4-(4-(三氟甲氧基)苯甲基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-5-methoxy-4-(4-(trifluoromethoxy)benzyl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.35 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.71 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 10.0, 2.4 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 8.9 Hz, 2H), 7.40 (t, J = 8.1 Hz, 3H), 4.87 (s, 2H), 4.19 (s, 3H); ESI MS (m/z): 501.20[M+1].
354	4-(4-氯苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(4-chlorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.22 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.47 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.15 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 2.1 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.45-7.42 (m, 2H), 7.37-7.34 (m, 2H), 4.78 (s, 2H), 4.05 (s, 3H); ESI MS (m/z): 433.10[M+1].
355	4-(2-氟苯甲基)-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-5-甲氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(2-fluorobenzyl)-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-5-methoxy-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26-9.25 (m, 2H), 8.69 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.49 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.14 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.41-7.33 (m, 2H), 7.26-7.19 (m, 2H), 4.84 (s, 2H), 4.05 (s, 3H); ESI MS (m/z): 434.90[M+1].
356	4-(2-氟苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(2-fluorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.34 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 9.31 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.1, 4.4 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.41-7.35 (m, 3H), 7.27-7.20 (m, 2H), 4.88 (s, 2H), 4.17 (s, 3H) ESI MS (m/z): 416.90[M+1].
357	4-(2-氟苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(2-fluorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56 (s, 2H), 9.39 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.75 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.42-7.35 (m, 3H), 7.26-7.20 (m, 2H), 4.88 (s, 2H), 4.18 (s, 3H); ESI MS (m/z): 417.95[M+1].

[0625]

358	5-乙氧基-4-(2-氟苯甲基)-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-4-(2-fluorobenzyl)-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.21 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.47 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.13 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.94 (dd, J = 9.4, 2.1 Hz, 1H), 7.82 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.41-7.35 (m, 2H), 7.26-7.19 (m, 2H), 4.83 (s, 2H), 4.43 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.34 (t, J = 7.1 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 430.90[M+1].
359	5-乙氧基-4-(2-氟苯甲基)-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-4-(2-fluorobenzyl)-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.26 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.64 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.42-7.35 (m, 3H), 7.27-7.20 (m, 2H), 4.87 (s, 2H), 4.57 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 430.90[M+1].
360	5-乙氧基-4-(2-氟苯甲基)-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-4-(2-fluorobenzyl)-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (s, 2H), 9.35 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.74 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.42-7.37 (m, 3H), 7.27-7.20 (m, 2H), 4.87 (s, 2H), 4.59 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 431.95[M+1].
361	5-乙氧基-4-(2-氟苯甲基)-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-4-(2-fluorobenzyl)-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25-9.24 (m, 2H), 8.68 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.49 (dt, J = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.41-7.35 (m, 2H), 7.26-7.19 (m, 2H), 4.83 (s, 2H), 4.43 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.34 (t, J = 7.0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 449.25[M+1].
362	4-(3-氟苯甲基)-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-5-甲氧基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(3-fluorobenzyl)-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-5-methoxy-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20-9.32 (2H), 8.63-8.75 (1H), 8.41-8.55 (1H), 8.09-8.20 (1H), 7.94-8.03 (1H), 7.79-7.89 (1H), 7.36-7.48 (1H), 7.09-7.23 (3H), 4.76-4.85 (2H), 4.02-4.09 (3H); ESI MS (m/z): 435.25[M+1].
363	4-(3-氟苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(3-fluorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56 (s, 2H), 9.40 (s, 1H), 9.28 (s, 1H), 7.75 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.46-7.39 (m, 2H), 7.19-7.14 (m, 3H), 4.85 (s, 2H), 4.19 (s, 3H); ESI MS (m/z): 418.15[M+1].
364	5-乙氧基-4-(3-氟苯甲基)-2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-4-(3-fluorobenzyl)-2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.25 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 8.69 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.49 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.5, 2.0 Hz, 1H), 7.83 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.43 (dd, J = 14.1, 8.2 Hz, 1H), 7.18-7.14 (m, 3H), 4.80 (s, 2H), 4.45 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z):

[0626]

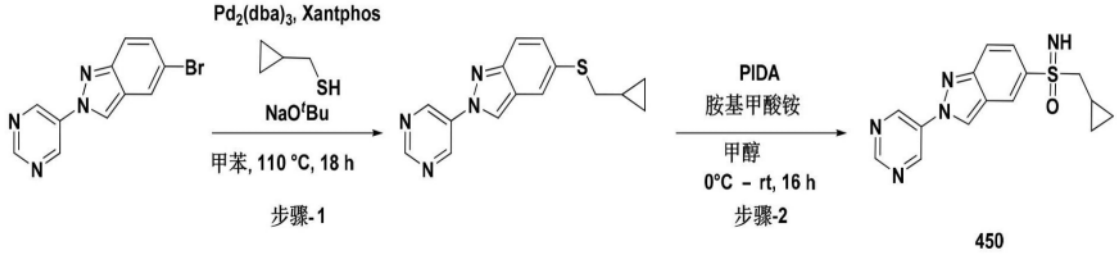
		449.15[M+1].
365	4-(3-氟苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(3-fluorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.32 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.1, 4.4 Hz, 1H), 7.57 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.46-7.36 (m, 2H), 7.19-7.14 (m, 3H), 4.85 (s, 2H), 4.18 (s, 3H) ESI MS (m/z): 417.05[M+1].
366	5-乙氧基-4-(3-氟苯甲基)-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-ethoxy-4-(3-fluorobenzyl)-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.67 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.65 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 7.56 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.46-7.36 (m, 2H), 7.19-7.14 (m, 3H), 4.84 (s, 2H), 4.59 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.40 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 431.00[M+1].
367	4-(2-氯苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(2-chlorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.22 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.47 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.17 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.98 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.66-7.63 (m, 1H), 7.52-7.50 (m, 1H), 7.38-7.34 (m, 2H), 7.27-7.25 (m, 1H), 4.87 (s, 2H), 4.04 (s, 3H); ESI MS (m/z): 433.05[M+1].
368	4-(3,4-二氯苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(3,4-dichlorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.22 (s, 1H), 8.65 (dd, J = 4.9, 1.2 Hz, 1H), 8.48-8.46 (m, 1H), 8.15 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.96 (dd, J = 9.5, 1.8 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.65 (q, J = 4.2 Hz, 3H), 7.32 (dd, J = 8.3, 1.8 Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 4.06 (s, 3H); ESI MS (m/z): 467.00[M+1].
369	4-(2,4-二氯苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(2,4-dichlorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.32 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 9.22 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.65 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.47 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.16 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.84 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.69 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.67-7.63 (m, 1H), 7.45 (dd, J = 8.6, 2.1 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 4.85 (s, 2H), 4.04 (s, 3H) ESI MS (m/z): 467.00[M+1].
370	5-甲氧基-4-甲基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (5-methoxy-4-methyl-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (s, 2H), 9.34-9.30 (m, 3H), 8.06 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 4.05 (s, 3H), 3.14 (s, 3H) ESI MS (m/z): 425.1[M+1].
371	2-(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-c]吡啶-5-基)-5-甲氧基-4-甲基-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (2-(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.40 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.31-9.29 (m, 2H), 8.78 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.58 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 4.03 (s, 3H), 3.12 (s, 3H); ESI

[0627]

	pyrazolo[3,4-c]pyridin-5-yl)-5-methoxy-4-methyl-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	MS (m/z): 341.9[M+1].
374	4-(2-氯苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(2-chlorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.05 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 9.42 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 8.34 (q, J = 3.0 Hz, 1H), 8.16 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.03 (dd, J = 9.5, 1.8 Hz, 1H), 7.87 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.51 (t, J = 4.6 Hz, 1H), 7.37-7.35 (m, 2H), 7.27 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 4.87 (s, 2H), 4.04 (s, 3H); ESI MS (m/z): 434.00[M+1].
375	4-(3,4-二氯苯甲基)-5-甲氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(3,4-dichlorobenzyl)-5-methoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 10.05 (q, J = 1.2 Hz, 1H), 9.43-9.41 (m, 2H), 8.34 (q, J = 2.9 Hz, 1H), 8.15 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.02 (dd, J = 9.5, 1.8 Hz, 1H), 7.86 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.65-7.63 (m, 2H), 7.32 (dd, J = 8.4, 2.0 Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 4.06 (s, 3H); ESI MS (m/z): 468.00[M+1].
379	4-(4-氯苯甲基)-5-乙氧基-2-(2-(嘧啶-5-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)-2,4-二氢-3H-1,2,4-三唑-3-酮 (4-(4-chlorobenzyl)-5-ethoxy-2-(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)-2,4-dihydro-3H-1,2,4-triazol-3-one)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56 (d, J = 4.9 Hz, 2H), 9.48 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.29 (s, 1H), 8.36 (dd, J = 9.5, 1.0 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.45 (dd, J = 6.6, 2.2 Hz, 2H), 7.38-7.35 (m, 2H), 4.78 (s, 2H), 4.46 (q, J = 7.1 Hz, 2H), 1.37 (t, J = 7.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 449.10[M+1].

[0628] 实例7:(环丙基甲基)(亚胺基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮((cyclopropylmethyl)(imino)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)450的合成

[0629]



[0630] 步骤-1:5-((环丙基甲基)硫基)-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑(5-((cyclopropylmethyl)thio)-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazole)的合成

[0631] 在经搅拌的5-溴-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑(5-bromo-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazole)(15g,54.5mmol)的甲苯(200mL)溶液中,于氮气气氛下加入Xantphos(9.46g,16.36mmol)以及叔丁醇钠(10.48g,109mmol),且反应混合物以氮气除气15分钟。加入三(二亚苯甲基丙酮)二钯(tris(dibenzylideneacetone)dipalladium)(9.99g,10.90mmol)以及环丙基甲硫醇(cyclopropylmethanethiol)(5.77mL,65.4mmol),且反应混合物于110℃加热18小时。反应完成后,反应混合物通过硅藻(celite)过滤并以乙酸乙酯清洗。过滤物以无水硫酸钠干燥、过滤并减压浓缩而得到粗半固体物质。粗产物以CombiFlash®层析纯化而得到5-((环丙基甲基)硫基)-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑(5-((cyclopropylmethyl)thio)-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazole)(15g,53.1mmol,产率97%)。

[0632] 步骤-2:(环丙基甲基)(亚胺基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮((cyclopropylmethyl)(imino)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)450的合成

[0633] 在经搅拌的5-((环丙基甲基)硫基)-2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑(5-((cyclopropylmethyl)thio)-2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazole)(15g,53.1mmol)的甲醇(230mL)溶液中,于0℃加入胺基甲酸铵(ammonium carbamate)(18.66g,239mmol)。反应混合物回复室温(25℃)并于此温度下搅拌1小时。反应混合物再次冷却至0℃并将二乙酸碘苯((diacetoxyiodo)benzene)(PIDA,37.6g,117mmol)加入。所得溶液于25℃搅拌16小时。反应完成后,甲醇减压浓缩,且粗剩余物以最少量的水(1X50 mL)稀释。此溶液再进一步以浓盐酸(pH=1-2)酸化且水溶液层以乙酸乙酯(3X200 mL)萃取以除去剩余的非极性有机杂质。水溶液层以碳酸氢钠溶液(pH=8)碱化并以氯仿(3X250 mL)萃取。合并的有机层以盐水溶液(1X250 mL)清洗、无水硫酸钠干燥、过滤并减压浓缩而得到粗固体物。此粗固体物再以甲基叔丁基醚(50mL)研制(triturated)而得到(环丙基甲基)(亚胺基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮((cyclopropylmethyl)(imino)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)450(10g,31.9mmol,产率60%)。

[0634] 表7:本公开的代表性化合物依据实例7所描述的合适的起始物与方法制备。

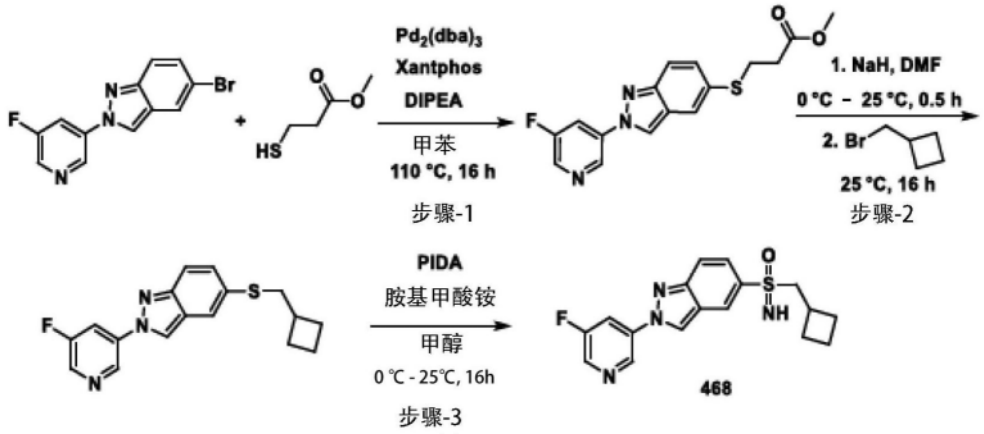
[0635]

化合物编号	化合物名称	分析数据
380	亚胺基(异丙基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-λ^6-硫烷酮 (imino(isopropyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.38 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.29 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.69 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.57 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.07-8.05 (m, 1H), 7.67-7.64 (m, 2H), 7.54 (dd, J = 8.7, 7.0 Hz, 1H), 4.41 (s, 1H), 3.52-3.45 (m, 1H), 1.18 (q, J = 3.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 300.55 [M+1].
381	亚胺基(异丙基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 (imino(isopropyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.36-9.33 (m, 1H), 8.71-8.68 (m, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.72-7.66 (m, 2H), 4.16 (s, 1H), 3.29-3.24 (m, 1H), 1.20-1.11 (m, 6H); ESI MS (m/z): 301.25 [M+1].
384	叔丁基(亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 (tert-butyl(imino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.72-7.66 (m, 2H), 1.24 (d, J = 12.8 Hz, 11H) ESI MS (m/z): 314.55 [M+1].
385	丁基(亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 (butyl(imino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.39 (s, 1H), 9.32 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.69 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.48 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.88 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.76 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 7.66 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 3.92 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 3.17 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 1.56 (dd, J = 15.6, 8.3 Hz, 2H), 1.32 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 0.82 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 315.2 [M+1].
386	(环丙基甲基)(亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 ((cyclopropylmethyl)(imino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.43-9.53 (1H), 9.30-9.40 (1H), 8.65-8.74 (1H), 8.47-8.57 (1H), 8.39-8.47 (1H), 7.85-7.94 (1H), 7.73-7.78 (1H), 7.65-7.71 (1H), 4.09-4.26 (1H), 3.07-3.20 (2H), 0.73-1.02 (1H), 0.24-0.45 (2H), -0.10-0.14 (2H) ESI MS (m/z): 313 [M+1].
387	乙基(亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.8,

[0636]

	(ethyl(imino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1.3 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.73 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 8.1, 4.9 Hz, 1H), 4.20 (s, 1H), 3.17 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.08 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 286.85 [M+1].
393	(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)(亚胺基)(异丙基)-λ^6-硫烷酮 ((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)(imino)(isopropyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (s, 1H), 9.30 (s, 1H), 9.02 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.85 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.78 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.61 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 4.51 (s, 1H), 3.43-3.36 (m, 1H), 1.19 (dd, J = 6.6, 4.2 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 319.5 [M+1].
395	(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)(异丙基)-λ^6-硫烷酮 ((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)(isopropyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.52 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 4.18 (s, 1H), 3.26 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 1.16 (q, J = 3.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 318.5 [M+1].
409	(环丙基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)-λ^6-硫烷酮 ((cyclopropylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.52 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.44 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.77 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 4.20 (s, 1H), 3.19-3.10 (m, 2H), 0.94-0.87 (m, 1H), 0.38-0.34 (m, 2H), 0.04-0.01 (m, 2H); ESI MS (m/z): 330.5 [M+1].
410	亚胺基(异丙基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 (imino(isopropyl)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56-9.54 (m, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.42 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.92 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.73 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 4.18 (s, 1H), 3.28 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 1.18-1.14 (m, 6H); ESI MS (m/z): 301.5 [M+1].
450	(环丙基甲基)(亚胺基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 ((cyclopropylmethyl)(imino)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56-9.53 (m, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.46 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.78 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 4.21 (s, 1H), 3.18-3.12 (m, 2H), 0.93-0.86 (m, 1H), 0.38-0.33 (m, 2H), 0.01 (dd, J = 4.6, 3.1 Hz, 2H) ESI MS (m/z): 313.9 [M+1].
454	(3-氯-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(环丙基甲基)(亚胺基)-λ^6-硫烷酮 ((3-chloro-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(cyclopropylmethyl)(imino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.03 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.82 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.32-8.29 (m, 2H), 7.91 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.83 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 7.74 (ddd, J = 8.3, 4.9, 0.6 Hz, 1H), 4.29 (s, 1H), 3.19 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 0.91 (s, 1H), 0.38 (dq, J = 8.0, 1.5 Hz, 2H), 0.05-0.03 (m, 2H) ESI MS (m/z): 346.9 [M+1].

[0637] 实例8:(环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)-λ^6-硫烷酮((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)-λ^6-sulfanone)468的合成

[0638] 

[0639] 步骤1:甲基3-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)硫基)丙酸酯(methyl 3-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)thio)propanoate)的合成

[0640] 在除气的5-溴-2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑(5-bromo-2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazole)(10g,34.2mmol)的甲苯(150mL)溶液中,于氮气气氛下加入Xantphos(9.90g,17.12mmol)、N,N-二异丙基乙胺(11.93mL,68.5mmol)、三(二亚苯甲基丙酮)二钯(tris(dibenzylideneacetone)dipalladium)(9.40g,10.27mmol)以及3-巯基丙酸甲酯(methyl 3-mercaptopropanoate)(4.55mL,41.1mmol),且所得反应混合物于110℃加热16小时。反应完成后,冷却至室温,以硅藻土过滤并以乙酸乙酯清洗。过滤物以无水硫酸钠干燥、过滤并减压浓缩而得到粗剩余物,其再以CombiFlash®层析纯化而得到所想要的呈淡黄色固体的甲基3-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)硫基)丙酸酯(methyl 3-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)thio)propanoate)(10g,30.2mmol,产率88%)。

[0641] 步骤2:5-((环丁基甲基)硫基)-2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑(5-((cyclobutylmethyl)thio)-2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazole)的合成

[0642] 在经搅拌的甲基3-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)硫基)丙酸酯(methyl 3-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)thio)propanoate)(4g,12.07mmol)的N,N-二甲基甲酰胺(20mL)溶液中,于0℃加入氢化钠(60%分散于矿物油中,0.966g,24.14mmol)并搅拌0.5小时,接着于相同温度下加入(溴甲基)丁烷((Bromomethyl)cyclobutane)(2.71mL,24.14mmol),且所得反应混合物以25℃搅拌16小时。反应完成后,以水(100mL)淬灭并以乙酸乙酯(3X100mL)萃取。合并的有机层以无水硫酸钠干燥、过滤并减压浓缩而得到粗产物5-((环丁基甲基)硫基)-2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑(5-((cyclobutylmethyl)thio)-2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazole)(3.5g,11.17mmol,产率93%),其直接使用于下一步骤。

[0643] 步骤3:(环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)-λ^6-硫烷酮((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)-λ^6-sulfanone)468的合成

[0644] 在经搅拌的5-((环丁基甲基)硫基)-2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑(5-((cyclobutylmethyl)thio)-2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazole)(3.78g,12.06mmol)的甲醇(50mL)溶液中,于0℃加入胺基甲酸铵(ammonium carbamate)(4.24g,54.3mmol)并于25℃搅拌0.5小时。于0℃逐部分加入二乙酸碘苯(iodobenzene diacetate)(8.55g,26.5mmol)且所得混合物以25℃搅拌16小时。反应完成后,反应混合物减压浓缩,以

碳酸氢钠中和并以二氯甲烷(3X50 mL)萃取。合并的有机层以无水硫酸钠干燥、过滤并减压浓缩而得到粗固体。粗产物以CombiFlash®层析纯化而得到(环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)-λ⁶-硫烷酮((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)-λ⁶-sulfanone)468(2.3g,6.68mmol,产率55%)。

[0645] 表8:本公开的代表性化合物依据实例8所描述的合适的起始物与方法制备。

[0646]

化合物编号	化合物名称	分析数据
455	乙基(亚胺基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(imino)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56-9.54 (m, 3H), 9.30 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 8.43 (t, J = 0.8 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 4.23 (s, 1H), 3.20-3.15 (m, 2H), 1.08 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 288 [M+1].
458	亚胺基(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)(2,2,2-三氟乙基)-λ⁶-硫烷酮 (imino(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)(2,2,2-trifluoroethyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.58-9.56 (m, 3H), 9.32 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 8.56 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.84 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 5.03 (s, 1H), 4.64 (q, J = 10.1 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 342.05 [M+1].
460	乙基(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.52 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.41 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 4.22 (s, 1H), 3.17 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.08 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 304.85 [M+1].
465	(环丁基甲基)(亚胺基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclobutylmethyl)(imino)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.52 (s, 2H), 9.46 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.89 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.77 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.89 (s, 1H), 3.32 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 2.66-2.58 (m, 1H), 1.93-1.86 (m, 2H), 1.82-1.62 (m, 4H) ESI MS (m/z): 328.1 [M+1].
468	(环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.51 (d, J = 0.5 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 4.15 (s, 1H), 3.32 (s, 1H), 2.59-2.51 (m, 1H), 1.87-1.78 (m, 2H), 1.76-1.68 (m, 1H), 1.66-1.57 (m, 3H) ESI MS (m/z): 344.9 [M+1].
470	亚胺基(甲基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (imino(methyl)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56 (s, 2H), 9.55-9.54 (m, 1H), 9.31 (s, 1H), 8.47 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.93 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.82 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 4.25 (s, 1H), 3.11 (s, 3H); ESI MS (m/z): 274 [M+1].
478	(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)(丙基)- λ⁶-硫烷酮 ((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)(propyl)- λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.52 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.41 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 4.22 (s, 1H), 3.17-3.13 (m, 2H), 1.59-1.50 (m, 2H), 0.87 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 319 [M+1].
479	仲丁基(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (sec-butyl(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.51-9.49 (m, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.73-7.69 (m, 1H), 4.18 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 3.05 (qd, J = 6.9, 3.2 Hz, 1H),

[0647]

		1.94-1.86 (m, 1H), 1.33-1.24 (m, 1H), 1.14 (dd, J = 9.3, 6.8 Hz, 3H), 0.87 (dd, J = 16.4, 7.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 333 [M+1].
480	(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)(戊-3-基)-λ⁶-硫烷酮 ((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)(pentan-3-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.51 (s, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.54 (d, J = 9.8 Hz, 1H), 8.40 (s, 1H), 7.90 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.73 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 4.18 (s, 1H), 2.92-2.89 (m, 1H), 1.85-1.75 (m, 2H), 1.63-1.52 (m, 2H), 0.92-0.86 (m, 6H); ESI MS (m/z): 347.05 [M+1].
482	(3-氟丙基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((3-fluoropropyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.53 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 8.44 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.93-7.91 (m, 1H), 7.76 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 4.52 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 4.41-4.38 (m, 2H), 3.27 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 2H), 1.99-1.87 (m, 2H); ESI MS (m/z): 336.85 [M+1].
484	(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)((3-甲基氧杂环丁烷-3-基)甲基)-λ⁶-硫烷酮 ((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)((3-methyloxetan-3-yl)methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.52 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.78 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 4.62 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 4.46 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 4.30 (s, 1H), 4.12 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 4.07 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 3.73 (d, J = 14.2 Hz, 1H), 3.60 (d, J = 14.4 Hz, 1H), 1.47 (s, 3H); ESI MS (m/z): 361 [M+1].
488	环丁基(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (cyclobutyl(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.51 (td, J = 7.3, 0.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.57-8.53 (m, 1H), 8.39 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.70 (ddd, J = 9.1, 5.1, 1.8 Hz, 1H), 4.19 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 4.01-3.93 (m, 1H), 2.39-2.29 (m, 2H), 2.12-1.93 (m, 2H), 1.90-1.73 (m, 2H) ESI MS (m/z): 331 [M+1].
554	环丁基(亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (cyclobutyl(imino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.89 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.70-7.66 (m, 2H), 4.18 (s, 1H), 4.00-3.92 (m, 1H), 2.39-2.29 (m, 2H), 2.11-1.94 (m, 2H), 1.88-1.76 (m, 2H); ESI MS (m/z): 312.9 [M+1]
555	(环己基甲基)(亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclohexylmethyl)(imino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 4.20 (s, 1H), 3.13-3.04 (m, 2H), 1.88-1.68 (m, 3H), 1.57-1.49 (m, 3H), 1.19-0.92 (m, 5H); ESI MS (m/z): 355.05 [M+1]
556	亚胺基(戊-3-基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H),

[0648]

	(imino(pentan-3-yl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	8.40 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 7.68 (q, J = 4.4 Hz, 1H), 4.16 (s, 1H), 2.91-2.88 (m, 1H), 1.85-1.75 (m, 2H), 1.63-1.52 (m, 2H), 0.92-0.86 (m, 6H); ESI MS (m/z): 329 [M+1]
557	亚胺基(异丁)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 (imino(isobutyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.69-7.66 (m, 1H), 4.20 (s, 1H), 3.14-3.05 (m, 2H), 2.08-2.01 (m, 1H), 0.91 (dd, J = 6.7, 1.5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 314.95 [M+1]
558	环戊基(亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 (cyclopentyl(imino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.46 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.42 (t, J = 0.8 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 7.69-7.66 (m, 1H), 4.10 (s, 1H), 3.67-3.63 (m, 1H), 1.93-1.70 (m, 4H), 1.60-1.48 (m, 4H) ESI MS (m/z): 326.9 [M+1]
559	环庚基(亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 (cycloheptyl(imino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.46 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.39 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.73-7.66 (m, 2H), 4.11 (s, 1H), 3.19-3.12 (m, 1H), 2.10-2.01 (m, 2H), 1.68-1.33 (m, 10H); ESI MS (m/z): 355 [M+1]
560	环己基(亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 (cyclohexyl(imino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.36 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.70-7.66 (m, 2H), 4.16 (s, 1H), 3.01-2.96 (m, 1H), 1.99-1.91 (m, 2H), 1.72 (d, J = 9.5 Hz, 2H), 1.55 (d, J = 12.2 Hz, 1H), 1.31-1.16 (m, 4H), 1.06-0.99 (m, 1H); ESI MS (m/z): 340.95 [M+1]
561	(2-环己基乙基)(亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 ((2-cyclohexylethyl)(imino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.47 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.69-7.66 (m, 1H), 4.19 (s, 1H), 3.16 (t, J = 8.3 Hz, 2H), 1.59-1.52 (m, 5H), 1.44-1.38 (m, 2H), 1.22 (s, 1H), 1.14-1.02 (m, 3H), 0.81-0.72 (m, 2H); ESI MS (m/z): 369.05 [M+1]
562	亚胺基(戊-2-基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 (imino(pentan-2-yl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.90 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.72-7.66 (m, 2H), 4.17 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 3.13-3.08 (m, 1H), 1.84-1.78 (m, 1H), 1.41-1.12 (m, 6H), 0.81 (q, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z):

[0649]

		328.95 [M+1]
563	亚胺基(异戊)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (imino(isopentyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.41 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 7.68 (ddd, J = 8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 4.21 (s, 1H), 3.16 (t, J = 8.2 Hz, 2H), 1.58-1.52 (m, 1H), 1.44-1.38 (m, 2H), 0.79 (d, J = 6.6 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 328.95 [M+1]
564	4-(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-磺酰亚胺酰)丁腈 (4-(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazole-5-sulfonimidoyl)butanenitrile)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.49 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.44 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 8.3, 4.6 Hz, 1H), 4.46 (s, 1H), 3.26 (dd, J = 8.7, 5.3 Hz, 2H), 2.61 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 1.88-1.80 (m, 2H); ESI MS (m/z): 326.05 [M+1]
569	亚胺基(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)((四氢呋喃-2-基)甲基)-λ⁶-硫烷酮 (imino(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)((tetrahydrofuran-2-yl)methyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.51 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.88 (dd, J = 9.2, 2.8 Hz, 1H), 7.78-7.75 (m, 1H), 7.68 (dd, J = 8.3, 4.6 Hz, 1H), 4.27 (s, 1H), 4.12 (dt, J = 17.0, 6.4 Hz, 1H), 3.62-3.37 (m, 4H), 1.94-1.87 (m, 1H), 1.79-1.68 (m, 2H), 1.56-1.46 (m, 1H); ESI MS (m/z): 342.9 [M+1].
580	亚胺基(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷酮 (imino(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.51 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.35 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.53-8.48 (m, 2H), 7.93 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.79 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.68 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 4.65 (s, 1H), 3.47-3.43 (m, 2H), 2.62-2.55 (m, 2H); ESI MS (m/z): 354.9 [M+1].
602	亚胺基(新戊)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (imino(neopentyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, MeOD) δ 9.31 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 9.22 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.68 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.57 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.52 (dq, J = 8.5, 1.3 Hz, 1H), 7.91 (dt, J = 9.3, 0.9 Hz, 1H), 7.84 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.69 (ddd, J = 8.4, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 3.43-3.36 (m, 2H), 1.15-1.03 (m, 9H); ESI MS (m/z): 329 [M+1].
609	亚胺基(丙基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (imino(propyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, MeOD) δ 9.31 (s, 1H), 9.23-9.22 (m, 1H), 8.67 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.55-8.51 (m, 2H), 7.91 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.82 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 3.30 (t, J = 1.6 Hz, 2H), 1.75-1.66 (m, 2H), 0.99-0.95 (m, 3H) ESI MS (m/z): 301.1 [M+1].
619	亚胺基(异丙基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (imino(isopropyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridin-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.78 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.39 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.74 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.56 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 8.02 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.71 (ddd, J = 8.3, 4.9, 0.6 Hz, 1H), 4.49 (s,

[0650]

		1H), 3.76-3.69 (m, 1H), 1.20 (dd, J = 16.0, 6.9 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 302.0 [M+1].

[0651] 实例9:(环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)((6(三氟甲基)吡嗪-2-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)((6(trifluoromethyl)pyrazin-2-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)473的合成

[0652] 

[0653] 在除气的(环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)-λ⁶-硫烷酮((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)-λ⁶-sulfanone)(300mg,0.871mmol)的甲苯(10mL)溶液中,加入叔丁醇钠(184mg,1.916mmol)、Xantphos(252mg,0.436mmol)、2-氯-6-(三氟甲基)吡嗪(2-chloro-6-(trifluoromethyl)pyrazine)(0.159mL,1.307mmol)以及三(二亚苯甲基丙酮)二钯(tris(dibenzylideneacetone)dipalladium(239mg,0.261mmol),所得反应混合物于回流条件下搅拌16小时。反应完成后,反应混合物以硅藻土过滤并以额外体积的乙酸乙酯(3X10 mL)清洗。集合的悬浮物于减压下浓缩而得到粗剩余物,其再以制备级高效液相管柱层析纯化而得到所想要的(环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)((6(三氟甲基)吡嗪-2-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)((6(trifluoromethyl)pyrazin-2-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)473(130mg,0.265mmol,产率30.4%)。

[0654] 表9:本公开的代表性化合物依据实例9所描述的合适的起始物与方法制备。

[0655]

化合物编号	化合物名称	分析数据
448	(环丙基甲基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)((2,4,5-三氟苯基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮((cyclopropylmethyl)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)((2,4,5-trifluorophenyl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (d, J = 8.6 Hz, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.56 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 7.41 (td, J = 10.7, 7.9 Hz, 1H), 6.99-6.92 (m, 1H), 3.66 (dq, J = 23.8, 7.3 Hz, 2H), 1.00-0.94 (m, 1H), 0.50-0.38 (m, 2H), 0.23-0.02 (m, 2H); ESI MS (m/z): 444.05 [M+1].
451	(环丙基甲基)((5-氟吡啶-2-基)亚胺基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮((cyclopropylmethyl)((5-fluoropyridin-2-yl)imino)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55-9.53 (m, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.54 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.94-7.91 (m, 2H), 7.73 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.49 (td, J = 8.7, 3.1 Hz, 1H), 6.85 (dd, J = 9.0, 3.8 Hz, 1H), 3.64 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 0.91 (dd, J = 11.9, 7.0 Hz, 1H), 0.44-0.34 (m, 2H), 0.10 (q, J = 4.7 Hz, 1H), -0.03 (q, J = 4.8 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 409.05 [M+1].
452	(环丙基甲基)(吡啶-2-基亚胺基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮((cyclopropylmethyl)(pyridin-2-ylimino)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (d, J = 5.8 Hz, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.55 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.93-7.91 (m, 2H), 7.74 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.56-7.51 (m, 1H), 6.82 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 6.73 (ddd, J = 7.2, 5.0, 0.9 Hz, 1H), 3.67 (dd, J = 7.2, 1.7 Hz, 2H), 0.91-0.88 (m, 1H), 0.44-0.32 (m,

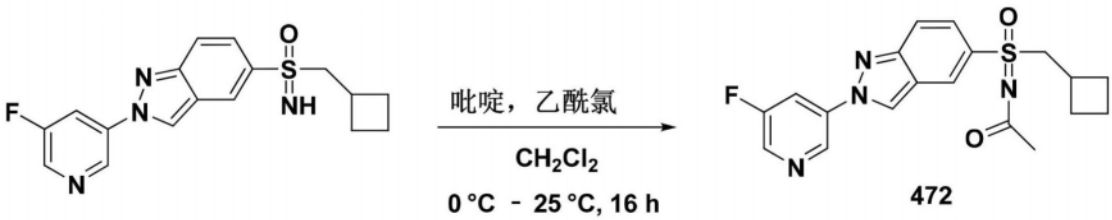
[0656]

	indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	2H), 0.11-0.06 (m, 1H), 0.05-0.0 (m, 1H); ESI MS (m/z): 391.1 [M+1].
453	(环丙基甲基)((2-甲氧基嘧啶-5-基)亚胺基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclopropylmethyl)((2-methoxypyrimidin-5-yl)imino)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.53 (d, J = 1.7 Hz, 3H), 9.32 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.15 (d, J = 5.1 Hz, 2H), 7.95 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.76-3.71 (m, 3H), 3.69-3.61 (m, 2H), 1.00 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 0.53-0.46 (m, 1H), 0.43-0.36 (m, 1H), 0.23 (td, J = 9.5, 4.8 Hz, 1H), 0.04 (td, J = 9.7, 4.7 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 422.1 [M+1].
459	乙基(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)((6-(三氟甲基)吡嗪-2-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)((6-(trifluoromethyl)pyrazin-2-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56 (s, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.63 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.96 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.73 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.88-3.80 (m, 2H), 1.25-1.16 (m, 3H); ESI MS (m/z): 434.1 [M+1].
463	乙基(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)((6-(三氟甲基)吡嗪-2-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)((6-(trifluoromethyl)pyrazin-2-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.60 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.88-3.78 (m, 2H), 1.20 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 451.1 [M+1].
464	乙基(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)((2-甲基吡啶-4-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)((2-methylpyridin-4-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.52 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.54-8.51 (m, 2H), 7.97 (t, J = 5.5 Hz, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.68-7.65 (m, 1H), 6.70 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.60 (dd, J = 5.5, 2.1 Hz, 1H), 3.67-3.57 (m, 2H), 2.21 (d, J = 14.4 Hz, 3H), 1.22-1.16 (m, 3H); ESI MS (m/z): 396.05 [M+1].
469	(环丁基甲基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)((6-(三氟甲基)吡嗪-2-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclobutylmethyl)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)((6-(trifluoromethyl)pyrazin-2-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (s, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.62 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 7.95 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.5, 1.8 Hz, 1H), 4.03-3.93 (m, 2H), 2.71-2.65 (m, 1H), 1.99-1.93 (m, 1H), 1.85-1.57 (m, 5H) ESI MS (m/z): 474 [M+1].
473	(环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)((6-(三氟甲基)吡嗪-2-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)((6-(trifluoromethyl)pyrazin-2-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.05 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.72 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.59 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.14 (dt, J = 8.9, 2.4 Hz, 1H), 7.90-7.87 (m, 1H), 7.69 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.82 (q, J = 7.0 Hz, 1H), 3.71 (q, J = 7.2 Hz, 1H), 2.84 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 2.14 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 1.95-1.77 (m, 5H), 1.64 (t, J = 8.3 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 491.25 [M+1].
476	(环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)((6-(三氟甲基)吡啶-3-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclobutylmethyl)(2-(5-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.51 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.56 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.52 (dt, J = 9.7, 2.3 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.55 (d, J

[0657]

	fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)((6-(trifluoromethyl)pyridin-3-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	= 8.6 Hz, 1H), 7.34 (dd, J = 8.3, 2.2 Hz, 1H), 3.86 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 2.71 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 2.06-2.00 (m, 1H), 1.86-1.79 (m, 3H), 1.69 (dd, J = 16.4, 7.6 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 490.2 [M+1].
477	(环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)((6-(三氟甲基)吡啶-2-基)亚胺基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)((6-(trifluoromethyl)pyridin-2-yl)imino)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.53 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.57-8.53 (m, 2H), 7.91 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.78-7.70 (m, 2H), 7.17 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 3.92 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 2.66-2.59 (m, 1H), 1.98-1.93 (m, 1H), 1.80-1.70 (m, 3H), 1.66-1.55 (m, 2H) ESI MS (m/z): 490.05 [M+1].
481	(环丁基甲基)((2-甲基吡啶-4-基)亚胺基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclobutylmethyl)((2-methylpyridin-4-yl)imino)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.52 (s, 3H), 9.31 (s, 1H), 8.53 (s, 1H), 7.98-7.94 (m, 2H), 7.69-7.66 (m, 1H), 6.68 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 6.58 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 3.77 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 2.73-2.65 (m, 1H), 2.23 (s, 3H), 1.98-1.95 (m, 1H), 1.85-1.80 (m, 3H), 1.72-1.62 (m, 2H); ESI MS (m/z): 419.1 [M+1].

[0658] 实例10:N-((环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-yl)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺(N-((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)472的合成

[0659] 

[0660] 在经搅拌的(环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)-λ⁶-硫烷酮((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)-λ⁶-sulfanone)(250mg,0.726mmol)的二氯甲烷(6mL)溶液中,加入吡啶(0.088mL,1.089mmol),且所得反应混合物搅拌10分钟。反应混合物冷却至0℃,且乙酰氯(acetyl chloride)(0.057mL,0.798mmol)加入反应混合物中,于25℃搅拌16小时。反应完成后,反应混合物倒入水(10mL),且水溶液层以二氯甲烷(3X20 mL)萃取。有机层以无水硫酸钠干燥、过滤并减压浓缩而得到粗固体物。粗产物以制备级高效液相管柱层析纯化而得到所想要的N-((环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-yl)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺(N-((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)472(110mg,0.285mmol,产率39.2%)。

[0661] 表10:本公开的代表性化合物依据实例10所描述的合适的起始物与方法制备。

[0662]

化合物编号	化合物名称	分析数据
389	N-(异丙基(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(isopropyl(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-D6) δ 9.49 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 8.44 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.71-7.67 (m, 1H), 7.61 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.77-3.70 (m, 1H), 2.01 (s, 3H), 1.30 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.25-1.22 (m, 1H), 1.12 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z):

[0663]

		343.15 [M+1].
394	2,2,2-三氟-N-(异丙基(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (2,2,2-trifluoro-N-(isopropyl(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.73 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.59 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.52 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.72-7.63 (m, 2H), 4.13-4.06 (m, 1H), 1.41 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.22-1.18 (m, 3H); ESI MS (m/z): 396.5 [M+1].
396	2,2-二氟-N-(异丙基(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (2,2-difluoro-N-(isopropyl(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.72 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.54-8.50 (m, 2H), 8.04 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.71-7.68 (m, 1H), 7.64 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 6.22 (t, J = 54.3 Hz, 1H), 3.99-3.93 (m, 1H), 1.37 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.17 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 378.45 [M+1].
398	2,2,2-三氟-N-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(异丙基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (2,2,2-trifluoro-N-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(isopropyl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.60 (s, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.78 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.61 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.57 (dd, J = 9.8, 2.2 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 4.10 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 1.41 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.22 (s, 1H), 1.18 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 414.95 [M+1].
399	N-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(异丙基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(isopropyl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-D6) δ 9.53 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.77-3.70 (m, 1H), 2.01 (s, 3H), 1.31 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.12 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361.1 [M+1].
401	2,2,2-三氟-N-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)(异丙基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (2,2,2-trifluoro-N-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)(isopropyl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.63 (s, 1H), 9.31 (s, 1H), 9.16 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.01 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.82 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.64 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 4.22 (m, J = 6.7 Hz, 1H), 1.44 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.24 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 415.45 [M+1].
402	N-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)(异丙基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)(isopropyl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-D6) δ 9.55 (s, 1H), 9.30 (s, 1H), 8.97 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.93 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.80 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.62 (dt, J = 9.7, 2.3 Hz, 1H), 3.84 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 2.04 (s, 3H), 1.34 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.18 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361.95 [M+1].
403	2,2-二氟-N-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(异丙基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (2,2-difluoro-N-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(isopropyl)(oxo)-λ⁶-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.58 (s, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.77 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.59-8.56 (m, 2H), 8.03 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 6.22 (t, J = 54.3 Hz, 1H), 4.00-3.93 (m, 1H), 1.37 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.17 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 396.9 [M+1].

[0664]

	sulfaneylidene)acetamide)	
404	2,2-二氟-N-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)(异丙基)(侧氧基)-λ^6-硫烷亚基)乙酰胺 (2,2-difluoro-N-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)(isopropyl)(oxo)-λ^6-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.61 (s, 1H), 9.31 (s, 1H), 9.09 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.99 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.81 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.63 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 6.25 (t, J = 54.2 Hz, 1H), 4.08 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 1.40 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.23 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 397.95 [M+1].
413	N-((环丙基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ^6-硫烷亚基)-2,2,2-三氟乙酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ^6-sulfaneylidene)-2,2,2-trifluoroacetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.62 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.28 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.78-8.77 (m, 1H), 8.66 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.57 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.08-8.05 (m, 1H), 7.75 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.99 (ddd, J = 26.4, 14.7, 7.1 Hz, 2H), 0.92-0.84 (m, 1H), 0.56-0.40 (m, 2H), 0.28 (td, J = 9.8, 4.6 Hz, 1H), 0.12 (td, J = 9.7, 4.5 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 426.9 [M+1].
415	N-((环丙基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ^6-硫烷亚基)乙酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ^6-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-D6) δ 9.55 (s, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.58-8.53 (m, 2H), 7.97 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.64 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 2.01 (s, 3H), 0.85-0.81 (m, 1H), 0.45-0.36 (m, 2H), 0.15-0.02 (m, 2H); ESI MS (m/z): 372.95 [M+1].
416	N-((环丙基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ^6-硫烷亚基)-2,2-二氟乙酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ^6-sulfaneylidene)-2,2-difluoroacetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.60 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.77 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.62 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 8.57 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 6.21 (t, J = 54.2 Hz, 1H), 3.91-3.81 (m, 2H), 0.91-0.84 (m, 1H), 0.52-0.38 (m, 2H), 0.22 (td, J = 9.5, 4.8 Hz, 1H), 0.09 (td, J = 9.6, 4.6 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 408.95 [M+1].
417	2,2,2-三氟-N-(异丙基(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)乙酰胺 (2,2,2-trifluoro-N-(isopropyl(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.62 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.56 (s, 2H), 9.34 (s, 1H), 8.64 (t, J = 1.0 Hz, 1H), 8.09 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.67 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 4.14-4.07 (m, 1H), 1.41 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.18 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 398.0 [M+1].
418	N-(异丙基(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(isopropyl(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-D6) δ 9.56-9.55 (m, 3H), 9.33 (s, 1H), 8.48 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.77-3.71 (m, 1H), 2.00 (d, J = 4.9 Hz, 3H), 1.30 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.12 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 343.5 [M+1].
421	2,2-二氟-N-(异丙基(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)乙酰胺 (2,2-difluoro-N-(isopropyl(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.60 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.56 (s, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.59 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 9.5, 1.8 Hz, 1H), 6.22 (t, J = 54.3 Hz, 1H), 4.00-3.93 (m, 1H), 1.37 (d, J = 6.4 Hz, 3H), 1.17 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 379.9 [M+1].

[0665]

	sulfaneylidene)acetamide)	
422	2,2,3,3,3-五氟-N-(异丙基(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)丙酰胺 (2,2,3,3,3-pentafluoro-N-(isopropyl(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)propanamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.63 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.56 (s, 2H), 9.34 (s, 1H), 8.62 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 4.11 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 1.41 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.19 (d, J = 6.7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 447.9 [M+1].
456	N-(乙基(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(ethyl(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-D6) δ 9.56 (s, 3H), 9.32 (s, 1H), 8.53 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.67-3.57 (m, 2H), 2.01 (s, 3H), 1.10 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 330 [M+1].
462	N-(乙基(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ^6-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(ethyl(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ^6-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-D6) δ 9.54 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.50 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.65-3.58 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.10 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 346.9 [M+1].
467	N-((环丁基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)乙酰胺 (N-((cyclobutylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-D6) δ 9.56 (t, J = 1.2 Hz, 3H), 9.32 (s, 1H), 8.52 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 9.5, 1.8 Hz, 1H), 3.78 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 2.58-2.54 (m, 1H), 1.99 (s, 3H), 1.93-1.89 (m, 1H), 1.79-1.57 (m, 5H); ESI MS (m/z): 369.95 [M+1].
472	N-((环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)- λ^6-硫烷亚基)乙酰胺 (N-((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)- λ^6-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.05 (s, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.61 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.53 (t, J = 0.8 Hz, 1H), 8.14 (dt, J = 8.9, 2.3 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.73 (dd, J = 14.2, 6.6 Hz, 1H), 3.59 (q, J = 7.3 Hz, 1H), 2.71 (q, J = 7.6 Hz, 1H), 2.17 (s, 3H), 2.09-2.05 (m, 1H), 1.91-1.74 (m, 4H), 1.64-1.60 (m, 1H); ESI MS (m/z): 387.1 [M+1].
475	N-(甲基(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(methyl(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.38 (s, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.74 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.60 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.97 (dd, J = 8.6, 0.9 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.40 (s, 3H), 2.19 (s, 3H); ESI MS (m/z): 316.05 [M+1].
483	N-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)(丙基)-λ^6-硫烷亚基)乙酰胺 (N-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)(propyl)-λ^6-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-D6) δ 9.54 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.50 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.66-3.52 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.63-1.45 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361 [M+1].
485	N-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)(戊-3-基)-λ^6-硫烷亚基)乙酰胺 (N-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-D6) δ 9.52 (s, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.56 (dd, J = 7.5, 2.3 Hz, 1H), 8.47 (s, 1H), 7.97 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.39 (d, J = 6.6 Hz,

[0666]

	yl)(oxo)(pentan-3-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H), 2.01-1.96 (m, 4H), 1.76 (td, J = 14.7, 7.7 Hz, 2H), 1.49 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.85 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 389.05 [M+1].
486	N-(仲丁基(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(sec-butyl(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-D6) δ 9.45 (dd, J = 13.0, 5.0 Hz, 1H), 9.24 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.72 (q, J = 2.4 Hz, 1H), 8.50-8.45 (m, 2H), 7.95 (q, J = 4.6 Hz, 1H), 7.65-7.62 (m, 1H), 3.58-3.54 (m, 1H), 2.18-1.80 (m, 4H), 1.48-1.15 (m, 4H), 0.94 (dtd, J = 32.3, 7.4, 4.1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 375.05 [M+1].
487	N-((3-氟丙基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-((3-fluoropropyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-D6) δ 9.55 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.58-8.54 (m, 2H), 7.99 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 4.54-4.39 (m, 2H), 3.80-3.63 (m, 2H), 2.06-1.86 (m, 5H) ESI MS (m/z): 379.1 [M+1].
565	N-(环丁基(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(cyclobutyl(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.34 (q, J = 2.5 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.53-8.49 (m, 1H), 8.45 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.98-7.94 (m, 1H), 7.72-7.67 (m, 1H), 7.60 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 4.37 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 2.56-2.53 (m, 1H), 2.32-2.20 (m, 2H), 1.97 (d, J = 7.3 Hz, 3H), 1.93-1.81 (m, 3H); ESI MS (m/z): 354.9 [M+1].
566	N-((环己基甲基)(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-((cyclohexylmethyl)(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.53-8.50 (m, 2H), 7.97 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.72-7.67 (m, 2H), 3.54 (dd, J = 19.6, 5.8 Hz, 2H), 1.97 (s, 3H), 1.79 (s, 2H), 1.61-1.51 (m, 4H), 1.08 (dd, J = 15.7, 8.4 Hz, 5H); ESI MS (m/z): 396.95 [M+1].
570	N-(乙基(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)丙酰胺 (N-(ethyl(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)propionamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.50 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.99-7.96 (m, 1H), 7.68 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.69-3.58 (m, 2H), 2.30 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 1.10 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 0.99 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361 [M+1].
571	N-(乙基(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)异丁酰胺 (N-(ethyl(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)isobutyramide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 8.49 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.67 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.63 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 2.46 (s, 1H), 1.09 (q, J = 7.0 Hz, 9H); ESI MS (m/z): 375.05 [M+1].
572	N-((环丁基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)环丙烷羧酰胺 (N-((cyclobutylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)cyclopropanecarbo	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56 (d, J = 2.4 Hz, 3H), 9.32 (s, 1H), 8.50 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.79 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 2.56 (d, J = 6.4 Hz, 1H), 1.93-1.90 (m, 1H), 1.79-1.73 (m, 3H), 1.69-1.59 (m, 3H), 0.80-0.73 (m, 4H); ESI MS (m/z): 396 [M+1].

[0667]

	xamide)	
573	N-((环丁基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)丙酰胺 (N-((cyclobutylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)propionamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56 (s, 3H), 9.32 (s, 1H), 8.52 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.78 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 2.57-2.53 (m, 1H), 2.29 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 1.94-1.89 (m, 1H), 1.79-1.58 (m, 5H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 384 [M+1].
574	N-((环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ^6-硫烷亚基)环丙烷羧酰胺 (N-((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ^6-sulfaneylidene)cyclopropanecarboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.7, 2.3 Hz, 1H), 8.47 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.67 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.83-3.74 (m, 2H), 2.59-2.51 (m, 1H), 1.96-1.87 (m, 1H), 1.80-1.57 (m, 6H), 0.84-0.73 (m, 4H) ESI MS (m/z): 413.05 [M+1].
575	N-((环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ^6-硫烷亚基)丁酰胺 (N-((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ^6-sulfaneylidene)butyramide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (t, J = 1.1 Hz, 1H), 8.75 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.48 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.82-3.73 (m, 2H), 2.58-2.51 (m, 1H), 2.27-2.20 (m, 2H), 1.95-1.87 (m, 1H), 1.81-1.60 (m, 5H), 1.58-1.48 (m, 2H), 0.87 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 415.05 [M+1].
576	N-((环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ^6-硫烷亚基)异丁酰胺 (N-((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ^6-sulfaneylidene)isobutyramide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.7, 2.3 Hz, 1H), 8.48 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.67 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.78 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 2.54 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 2.46 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 1.95-1.90 (m, 1H), 1.78-1.60 (m, 5H), 1.06 (d, J = 7.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 415.1 [M+1].
577	N-(乙基(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ^6-硫烷亚基)环丙基羧酰胺 (N-(ethyl(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ^6-sulfaneylidene)cyclopropanecarboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.76 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.48 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.98 (dt, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.67 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.68-3.56 (m, 2H), 1.68-1.62 (m, 1H), 1.10 (t, J = 7.3 Hz, 3H), 0.82-0.71 (m, 4H); ESI MS (m/z): 373 [M+1].
578	N-(乙基(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ^6-硫烷亚基)丁酰胺 (N-(ethyl(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ^6-sulfaneylidene)butyramide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.75 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 8.49 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.99-7.96 (m, 1H), 7.67 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.69-3.56 (m, 2H), 2.29-2.22 (m, 2H), 1.53 (td, J = 14.7, 7.3 Hz, 2H), 1.11-1.04 (m, 3H), 0.93-0.85 (m, 3H); ESI MS (m/z): 375 [M+1].
579	N-((环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ^6-硫烷亚基)丙酰胺 (N-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (d, J = 0.5 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.96 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz,

[0668]

	((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)propionamide)	1H), 3.82-3.73 (m, 2H), 2.57-2.52 (m, 1H), 2.28 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 1.95-1.87 (m, 1H), 1.79-1.58 (m, 5H), 0.99 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 401 [M+1].
581	N-(环戊基(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(cyclopentyl(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (s, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.52-8.49 (m, 1H), 8.47 (s, 1H), 7.96 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.8, 4.9 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 4.04 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 2.13-2.04 (m, 2H), 1.97 (s, 3H), 1.75 (dd, J = 13.0, 7.6 Hz, 1H), 1.66-1.50 (m, 5H); ESI MS (m/z): 369 [M+1].
582	N-(异戊基(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(isopentyl(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (s, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.53-8.50 (m, 2H), 7.98 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.72-7.67 (m, 2H), 3.68-3.55 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.57 (td, J = 13.3, 6.7 Hz, 1H), 1.52-1.43 (m, 1H), 1.36-1.27 (m, 1H), 0.80 (dd, J = 6.5, 4.3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 371 [M+1].
583	N-((3-腈丙基)(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-((3-cyanopropyl)(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.51 (s, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.72 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.53-8.50 (m, 2H), 8.00 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.71-7.68 (m, 2H), 3.77-3.60 (m, 2H), 2.61 (t, J = 7.3 Hz, 2H), 2.03 (s, 3H), 1.94-1.79 (m, 2H); ESI MS (m/z): 368 [M+1].
584	N-((3-腈丙基)(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)环丙基羧酰胺 (N-((3-cyanopropyl)(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)cyclopropanecarboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.52 (s, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.72-8.71 (m, 1H), 8.51 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 8.00 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.71-7.65 (m, 2H), 3.79-3.61 (m, 2H), 2.61 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 1.93-1.78 (m, 2H), 1.65 (dd, J = 13.0, 6.8 Hz, 1H), 0.83-0.77 (m, 4H); ESI MS (m/z): 394 [M+1].
590	N-(侧氧基(戊-3-基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(oxo(pentan-3-yl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.46 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.38 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 2.03-1.96 (m, 4H), 1.80-1.68 (m, 2H), 1.53-1.46 (m, 1H), 0.99 (t, J = 7.6 Hz, 3H), 0.85 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 370.95 [M+1].
591	N-(异丁基(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(isobutyl(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.49 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.52-8.49 (m, 2H), 7.98 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.72-7.67 (m, 2H), 3.59 (dd, J = 14.4, 6.4 Hz, 1H), 3.49 (dd, J = 14.4, 6.4 Hz, 1H), 2.02 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 1.98 (s, 3H), 0.98 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 0.88 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 356.9 [M+1].
592	N-(环庚基(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(cycloheptyl(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.96 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.69 (q, J = 4.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.69-3.64

	λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	(m, 1H), 2.30-2.27 (m, 1H), 2.00 (s, 3H), 1.95-1.90 (m, 1H), 1.68-1.60 (m, 3H), 1.53-1.34 (m, 7H); ESI MS (m/z): 397.05 [M+1].
593	N-((2-环己基乙基)(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-((2-cyclohexylethyl)(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.53-8.50 (m, 2H), 7.97 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.71-7.67 (m, 2H), 3.67-3.60 (m, 2H), 1.99 (s, 3H), 1.59-1.51 (m, 5H), 1.50-1.44 (m, 1H), 1.34-1.21 (m, 2H), 1.11-1.01 (m, 3H), 0.78 (dd, J = 21.5, 9.9 Hz, 2H) ESI MS (m/z): 411.1 [M+1].
594	N-(侧氧基(戊-2-基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(oxo(pentan-2-yl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (s, 1H), 9.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.51 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.97 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.2, 4.8 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.3, 1.2 Hz, 1H), 3.62-3.58 (m, 1H), 2.00 (d, J = 6.6 Hz, 4H), 1.35-1.11 (m, 6H), 0.83 (dt, J = 36.4, 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 370.85 [M+1].
596	N-(侧氧基(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)((四氢呋喃-2-基)甲基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(oxo(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)((tetrahydrofuran-2-yl)methyl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (d, J = 4.2 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.51 (d, J = 10.8 Hz, 2H), 7.95 (dd, J = 9.3, 4.2 Hz, 1H), 7.74-7.67 (m, 2H), 4.16-4.05 (m, 1H), 3.93-3.82 (m, 2H), 3.59-3.42 (m, 2H), 2.00 (d, J = 16.6 Hz, 3H), 1.96-1.84 (m, 1H), 1.80-1.66 (m, 2H), 1.63-1.50 (m, 1H); ESI MS (m/z): 384.9 [M+1].
[0669] 598	N-((环己基甲基)(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)环丙基羧酰胺 (N-((cyclohexylmethyl)(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)cyclopropanecarboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (s, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 8.51 (d, J = 9.5 Hz, 2H), 7.97 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.70-7.67 (m, 2H), 3.58 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 3.52 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 1.79 (s, 2H), 1.63-1.51 (m, 5H), 1.11-1.00 (m, 5H), 0.76-0.73 (m, 4H); ESI MS (m/z): 423.15 [M+1].
599	N-((环己基甲基)(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)丙酰胺 (N-((cyclohexylmethyl)(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)propionamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (s, 1H), 9.34 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.71 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 8.52 (s, 2H), 7.97 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.72-7.67 (m, 2H), 3.57 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 3.52 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 2.27 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 1.79 (s, 2H), 1.61-1.51 (m, 4H), 1.11-1.05 (m, 4H), 0.97 (t, J = 7.6 Hz, 4H); ESI MS (m/z): 411 [M+1].
600	N-(异丁基(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)环丙烷羧酰胺 (N-(isobutyl(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)cyclopropanecarboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.52-8.49 (m, 2H), 7.98 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.71-7.67 (m, 2H), 3.60 (dd, J = 14.5, 6.2 Hz, 1H), 3.51 (dd, J = 14.4, 6.4 Hz, 1H), 2.01 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 1.61 (d, J = 6.6 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.89 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 0.78-0.74 (m, 4H); ESI MS (m/z): 383 [M+1].
601	N-(侧氧基(戊-2-基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)环丙烷羧酰胺 (N-(oxo(pentan-2-	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.32 (s, 1H), 8.77-8.74 (m, 2H), 8.46-8.45 (m, 2H), 7.89 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.68-7.62 (m, 2H), 3.59-3.49 (m, 1H),

[0670]

	yl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)cyclopropanecarboxamide)	2.21-2.16 (m, 1H), 1.82-1.77 (m, 1H), 1.48-1.23 (m, 6H), 1.02-0.98 (m, 2H), 0.96-0.80 (m, 5H); ESI MS (m/z): 397.05 [M+1].
605	N-(侧氧基(戊-3-基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)环丙烷羧酰胺 (N-(oxo(pentan-3-yl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)cyclopropanecarboxamide)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.28 (s, 1H), 8.81-8.73 (m, 2H), 8.48 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.41 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.86 (dd, J = 15.0, 8.7 Hz, 1H), 7.67-7.58 (m, 2H), 3.28-3.22 (m, 1H), 2.19-2.08 (m, 1H), 1.92-1.75 (m, 3H), 1.68-1.57 (m, 1H), 1.13-1.07 (m, 3H), 1.04-0.94 (m, 5H), 0.85-0.77 (m, 2H) ESI MS (m/z): 397.2 [M+1].
606	N-(环己基(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(cyclohexyl(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, MeOD) δ 9.34 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 9.27 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.9, 1.5 Hz, 1H), 8.57-8.53 (m, 2H), 7.97 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.73-7.69 (m, 2H), 4.60 (s, 1H), 3.51-3.45 (m, 1H), 2.35 (s, 1H), 2.14 (s, 3H), 1.94 (d, J = 15.2 Hz, 2H), 1.86 (d, J = 11.7 Hz, 1H), 1.69 (s, 1H), 1.49-1.30 (m, 4H); ESI MS (m/z): 382.9 [M+1].
607	N-(侧氧基(戊-2-基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)丙酰胺 (N-(oxo(pentan-2-yl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)propionamide)	1H-NMR (400 MHz, MeOD) δ 9.31 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 9.25 (s, 1H), 8.68 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.54-8.51 (m, 2H), 7.95-7.92 (m, 1H), 7.70-7.66 (m, 2H), 4.57 (s, 1H), 3.60-3.53 (m, 1H), 2.44-2.38 (m, 2H), 2.16-1.80 (m, 1H), 1.41 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 1.24 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 1.15-1.09 (m, 3H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 0.86 (t, J = 7.2 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 385.05 [M+1].
608	N-(侧氧基(戊-3-基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)丙酰胺 (N-(oxo(pentan-3-yl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)propionamide)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.29 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.76-8.74 (m, 2H), 8.49 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.44 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.88 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.66-7.62 (m, 2H), 3.30-3.24 (m, 1H), 2.44 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 2.19-2.09 (m, 1H), 1.90-1.79 (m, 2H), 1.68-1.57 (m, 1H), 1.17-1.07 (m, 6H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 384.95 [M+1].
611	N-(侧氧基(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(3,3,3-三氟丙基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(oxo(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.21 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.73-8.71 (m, 2H), 8.66 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.30 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 7.55-7.52 (m, 1H), 4.16-4.11 (m, 1H), 4.00-3.94 (m, 1H), 3.55-3.48 (m, 1H), 3.44-3.37 (m, 1H), 2.61-2.54 (m, 1H), 2.41-2.34 (m, 1H); ESI MS (m/z): 396.85 [M+1].
613	N-(新戊基(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(neopentyl(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, METHANOL-D4) δ 9.30 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.68 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.59 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.52 (dq, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.76 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 3.71 (d, J = 14.7 Hz, 1H), 3.47 (d, J = 14.7 Hz, 1H), 2.05 (d, J = 14.7 Hz, 3H), 1.12 (t, J = 14.7 Hz, 9H); ESI MS (m/z): 370.95 [M+1].
614	N-(新戊基(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)环丙烷羧酰胺 (N-	1H-NMR (400 MHz, METHANOL-D4) δ 9.30 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.67 (dd, J = 4.9, 1.2 Hz, 1H), 8.56 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.52 (dq, J = 8.3, 1.3

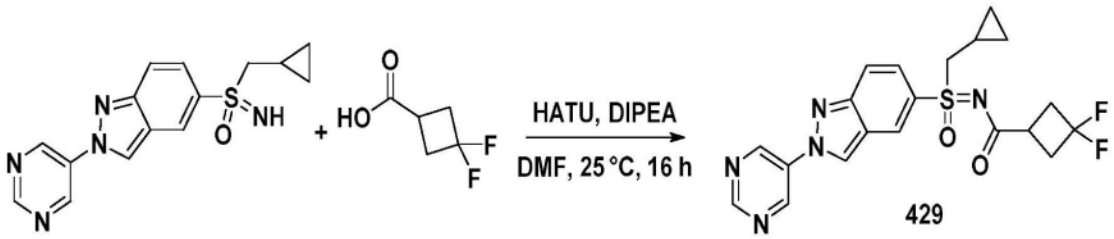
[0671]

	(neopentyl(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)cyclopropanecarboxamide)	Hz, 1H), 7.93 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 3.68 (d, J = 14.4 Hz, 1H), 3.42 (d, J = 14.5 Hz, 1H), 1.70-1.65 (m, 1H), 1.12 (d, J = 14.7 Hz, 9H), 0.98-0.81 (m, 4H); ESI MS (m/z): 397.1 [M+1].
616	N-(侧氧基(丙基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)乙酰胺 (N-(oxo(propyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.34 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.53-8.49 (m, 2H), 7.98 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.71-7.67 (m, 2H), 3.66-3.52 (m, 2H), 2.00 (s, 3H), 1.64-1.44 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 343.05 [M+1].

[0672] 对于氟化酰基类似物,使用对应的酸酐。

[0673] 实例11:N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)-3,3-二氟环丁烷-1-羧酰胺(N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)-3,3-difluorocyclobutane-1-carboxamide)429的合成

[0674]



[0675] 在经搅拌的(环丙基甲基)(亚胺基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮((cyclopropylmethyl)(imino)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)(250mg,0.798mmol)的N,N-二甲基甲酰胺(3mL)溶液中,于25℃加入3,3-二氟环丁烷-1-羧酸(3,3-difluorocyclobutane-1-carboxylic acid)(130mg,0.957mmol)以及1-[双(二甲基胺基)亚甲基]-1H-1,2,3-三唑并[4,5-b]吡啶鎓3-氧化物六氟磷酸盐(1-[Bis(dimethylamino)methylene]-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]pyridinium 3-oxide hexafluorophosphate)(455mg,1.197mmol)。接着,加入N,N-二异丙基乙基胺(N,N-diisopropylethylamine)(0.278mL,1.596mmol),且所得混合物于25℃搅拌16小时。反应完成之后,反应混合物加入水(10mL)淬灭,以乙酸乙酯(3X25mL)萃取并以盐水溶液(1X25 mL)清洗。有机层再以无水硫酸钠干燥、过滤并减压浓缩而得到粗胶状物。粗产物以制备级高效液相管柱层析纯化而得到所想要的N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)-3,3-二氟环丁烷-1-羧酰胺(N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)-3,3-difluorocyclobutane-1-carboxamide)429(88mg,0.204mmol,产率26%)。

[0676] 表11:本公开的代表性化合物依据实例11所描述的合适的起始物与方法制备。

[0677]

化合物编号	化合物名称	分析数据
420	1-腈基-N-(异丙基(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)环丙烷-1-羧酰胺 (1-cyano-N-(isopropyl(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)cyclopropane-1-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.58-9.56 (m, 3H), 9.33 (s, 1H), 8.53 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.91-3.85 (m, 1H), 1.64-1.46 (m, 4H), 1.36 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.17 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 394.6 [M+1].
423	N-(异丙基(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.57-9.56 (m, 3H), 9.32 (s, 1H), 8.42 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 8.01-

	1-甲基环丙烷-1-羧酰胺 (N-(isopropyl(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)-1-methylcyclopropane-1-carboxamide)	7.98 (m, 1H), 7.57 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.71 (q, J = 6.7 Hz, 1H), 1.28 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.21 (s, 3H), 1.15 (q, J = 2.8 Hz, 2H), 1.12 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.65 (dd, J = 9.0, 6.1 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 384.1 [M+1].
425	1-腈基-N-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(异丙基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)环丙烷-1-羧酰胺 (1-cyano-N-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(isopropyl)(oxo)-λ⁶-sulfaneylidene)cyclopropane-1-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.56 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.77 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.8, 2.4 Hz, 1H), 8.50 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.91-3.85 (m, 1H), 1.62-1.46 (m, 4H), 1.36 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.17 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 412 [M+1].
426	1-腈基-N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)环丙烷-1-羧酰胺 (1-cyano-N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)cyclopropane-1-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.62 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.56 (d, J = 12.0 Hz, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.61 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 8.04 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.77 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 1.65-1.49 (m, 4H), 0.88-0.82 (m, 1H), 0.50-0.40 (m, 2H), 0.23-0.09 (m, 2H); ESI MS (m/z): 406.9 [M+1].
427	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)-3,3,3-三氟-2,2-二甲基丙酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)-3,3,3-trifluoro-2,2-dimethylpropanamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.62 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.57 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.03 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.79-3.68 (m, 2H), 1.37 (d, J = 8.6 Hz, 6H), 0.83 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 0.44-0.39 (m, 2H), 0.18-0.08 (m, 2H); ESI MS (m/z): 452.1 [M+1].
428	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)环己烷羧酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)cyclohexanecarboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.59 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.56 (s, 2H), 9.32 (s, 1H), 8.54 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.65 (dq, J = 23.5, 7.3 Hz, 2H), 2.25-2.19 (m, 1H), 1.86 (d, J = 4.2 Hz, 2H), 1.70-1.58 (m, 3H), 1.38-1.13 (m, 5H), 0.81 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 0.45-0.35 (m, 2H), 0.13-0.03 (m, 2H); ESI MS (m/z): 424.2 [M+1].
429	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)-3,3-二氟环丁烷-1-羧酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)-3,3-difluorocyclobutane-1-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.59 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.58 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.73 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.72 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 3.03-2.99 (m, 1H), 2.84-2.74 (m, 4H), 0.83 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 0.47-0.37 (m, 2H), 0.16 (q, J = 4.7 Hz, 1H), 0.07-0.03 (m, 1H); ESI MS (m/z): 431.9 [M+1].
430	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)丁酰胺 (N-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.58-9.55 (m, 3H), 9.32 (d, J = 4.2 Hz, 1H), 8.55 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 9.2, 1.8

[0678]

[0679]

	((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)butyramide)	Hz, 1H), 3.66 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 2.26 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 1.54 (td, J = 14.7, 7.4 Hz, 2H), 0.92-0.80 (m, 4H), 0.47-0.34 (m, 2H), 0.13 (td, J = 9.3, 4.9 Hz, 1H), 0.07-0.02 (m, 1H); ESI MS (m/z): 383.95 [M+1].
431	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)-1-氟环丙烷-1-羧酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)-1-fluorocyclopropane-1-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.60 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.32 (d, J = 4.2 Hz, 1H), 8.58 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 8.02 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.72 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 1.36-1.30 (m, 4H), 0.86-0.80 (m, 1H), 0.50-0.37 (m, 2H), 0.17 (td, J = 9.4, 4.8 Hz, 1H), 0.07 (td, J = 9.4, 4.8 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 399.9 [M+1].
432	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)-2,2-二氟环丙烷-1-羧酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)-2,2-difluorocyclopropane-1-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.60 (t, J = 1.2 Hz, 1H), 9.57 (d, J = 4.2 Hz, 2H), 9.33-9.30 (m, 1H), 8.58 (dq, J = 5.9, 0.8 Hz, 1H), 8.01 (dd, J = 9.0, 3.7 Hz, 1H), 7.73 (dt, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 3.78-3.69 (m, 2H), 2.77-2.67 (m, 1H), 1.94-1.82 (m, 2H), 0.87-0.81 (m, 1H), 0.49-0.36 (m, 2H), 0.19-0.12 (m, 1H), 0.10-0.03 (m, 1H); ESI MS (m/z): 417.9 [M+1].
433	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)-2-氟环丙烷-1-羧酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)-2-fluorocyclopropane-1-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.58 (s, 1H), 9.56 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 9.32 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.56 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 8.01-7.99 (m, 1H), 7.73 (dd, J = 9.3, 1.0 Hz, 1H), 4.98 (s, 1H), 3.69 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 2.17-2.08 (m, 1H), 1.49-1.41 (m, 1H), 1.19 (dt, J = 18.2, 6.4 Hz, 1H), 0.83 (s, 1H), 0.48-0.38 (m, 2H), 0.15 (dd, J = 8.8, 5.1 Hz, 1H), 0.07 (s, 1H); ESI MS (m/z): 399.85 [M+1].
434	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)-3-甲基环丁烷-1-羧酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)-3-methylcyclobutane-1-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.59 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.32 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.53 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.71 (qd, J = 4.6, 1.9 Hz, 1H), 3.66 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 2.98-2.89 (m, 1H), 2.32-2.29 (m, 1H), 2.27-2.20 (m, 2H), 1.77-1.68 (m, 2H), 1.08 (d, J = 6.4 Hz, 1H), 0.98 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 0.83-0.78 (m, 1H), 0.47-0.34 (m, 2H), 0.17-0.11 (m, 1H), 0.07-0.02 (m, 1H); ESI MS (m/z): 410 [M+1].
435	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)-2,2-二氟丁酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)-2,2-difluorobutanamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.62 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.63 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.91-3.81 (m, 2H), 2.15-2.01 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.89-0.82 (m, 1H), 0.52-0.38 (m, 2H), 0.23 (td, J = 9.5, 4.8 Hz, 1H), 0.09 (td, J = 9.7, 4.5 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 419.95 [M+1].
436	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)环戊烷羧酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.59 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.56 (s, 2H), 9.32 (d, J = 4.2 Hz, 1H), 8.54 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.71-3.61 (m, 2H), 2.77-

[0680]

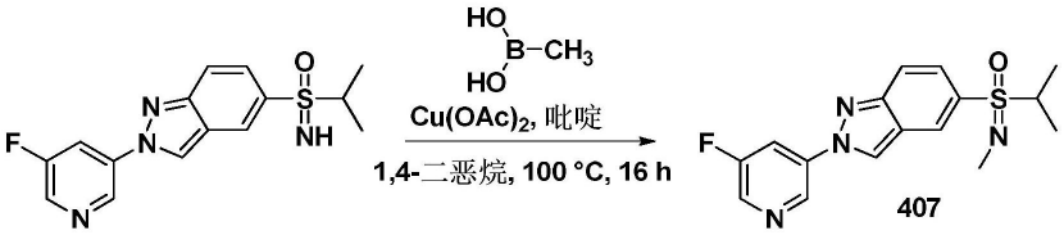
	(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)cyclopentanecarboxamide)	2.69 (m, 1H), 1.82-1.70 (m, 4H), 1.61-1.48 (m, 4H), 0.84-0.78 (m, 1H), 0.46-0.34 (m, 2H), 0.15-0.03 (m, 2H); ; ESI MS (m/z): 409.9 [M+1].
437	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)-2,2-二甲基环丙烷-1-羧酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)-2,2-dimethylcyclopropane-1-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.57 (dd, J = 6.9, 1.1 Hz, 3H), 9.32 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.53 (qd, J = 1.9, 0.9 Hz, 1H), 8.01-7.96 (m, 1H), 7.71 (dt, J = 9.2, 1.7 Hz, 1H), 3.65 (d, J = 7.0 Hz, 2H), 1.67-1.62 (m, 1H), 1.13 (d, J = 2.8 Hz, 3H), 1.08 (d, J = 22.9 Hz, 3H), 0.86-0.81 (m, 2H), 0.72 (q, J = 3.8 Hz, 1H), 0.46-0.35 (m, 2H), 0.15-0.11 (m, 1H), 0.03 (q, J = 4.7 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 410 [M+1].
438	3-腈基-N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)丙酰胺 (3-cyano-N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)propanamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.58-9.53 (m, 3H), 9.32 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.60 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.76 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.75-3.65 (m, 2H), 2.69-2.60 (m, 4H), 0.90-0.83 (m, 1H), 0.47-0.36 (m, 2H), 0.16-0.04 (m, 2H) ESI MS (m/z): 394.75 [M+1].
439	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(异丙基硫基)乙酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(isopropylthio)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.60 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.32 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.58 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.77-7.73 (m, 1H), 3.71-3.63 (m, 2H), 3.28-3.23 (m, 2H), 3.06-3.00 (m, 1H), 1.25-1.14 (m, 6H), 0.89-0.82 (m, 1H), 0.47-0.35 (m, 2H), 0.17-0.03 (m, 2H); ESI MS (m/z): 430.1 [M+1].
440	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)-2-(异丁基硫基)乙酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)-2-(isobutylthio)acetamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.59 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.32 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.58 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.73-3.63 (m, 2H), 3.22 (dd, J = 18.6, 13.9 Hz, 2H), 2.47 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 1.82-1.72 (m, 1H), 0.94-0.83 (m, 7H), 0.47-0.35 (m, 2H), 0.10 (tq, J = 18.1, 4.8 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 444.3 [M+1].
441	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)-1-甲基环丙烷-1-羧酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)-1-methylcyclopropane-1-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.59 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.56 (s, 2H), 9.32 (s, 1H), 8.52 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.67-3.58 (m, 2H), 1.25-1.20 (m, 3H), 1.16 (d, J = 2.9 Hz, 2H), 0.82-0.77 (m, 1H), 0.70-0.64 (m, 2H), 0.47-0.36 (m, 2H), 0.15-0.04 (m, 2H) ESI MS (m/z): 396.15 [M+1].
442	1-腈基-N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)环丁烷-1-羧酰胺 (1-cyano-N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)cyclobutane-1-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.63 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.63 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.76 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 3.82 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 2.66-2.52 (m, 4H), 2.15-1.96 (m, 2H), 0.87-0.82 (m, 1H), 0.50-0.39 (m, 2H), 0.21 (td, J = 9.2, 4.9 Hz, 1H), 0.14-0.08 (m, 1H); ESI MS (m/z): 421 [M+1].

[0681]

	carboxamide)	
443	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)-3,3-二甲基环丁烷-1-羧酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanylidene)-3,3-dimethylcyclobutane-1-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.59 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.32 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.54 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.66 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 3.11-3.02 (m, 1H), 1.98-1.85 (m, 4H), 1.13 (s, 3H), 1.02 (t, J = 12.2 Hz, 3H), 0.83-0.79 (m, 1H), 0.45-0.36 (m, 2H), 0.16-0.11 (m, 1H), 0.07-0.02 (m, 1H); ESI MS (m/z): 424.4 [M+1].
444	N-((环丙基甲基)(侧氧基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)-1-甲基环丁烷-1-羧酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(oxo)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanylidene)-1-methylcyclobutane-1-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.60 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.57 (s, 2H), 9.32 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 8.54 (q, J = 0.9 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.73-3.62 (m, 2H), 2.44-2.36 (m, 2H), 1.93-1.84 (m, 1H), 1.76-1.69 (m, 3H), 1.36 (d, J = 9.8 Hz, 3H), 0.83-0.78 (m, 1H), 0.46-0.36 (m, 2H), 0.15-0.05 (m, 2H); ESI MS (m/z): 410.45 [M+1].
445	N-((2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(异丙基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)环己烷羧酰胺 (N-((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(isopropyl)(oxo)-λ⁶-sulfanylidene)cyclohexanecarboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.56 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.41 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.79-3.72 (m, 1H), 2.22 (qd, J = 7.2, 3.6 Hz, 1H), 1.89-1.82 (m, 2H), 1.68 (t, J = 4.4 Hz, 2H), 1.59 (d, J = 11.6 Hz, 1H), 1.37-1.12 (m, 11H); ESI MS (m/z): 429.3 [M+1].
449	N-((环丙基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(侧氧基)-λ⁶-硫烷亚基)-1-甲基环丙烷-1-羧酰胺 (N-((cyclopropylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(oxo)-λ⁶-sulfanylidene)-1-methylcyclopropane-1-carboxamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.58 (s, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.76 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.58-8.54 (m, 1H), 8.49 (s, 1H), 7.98 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.63-3.61 (m, 2H), 1.24 (d, J = 8.8 Hz, 3H), 1.16 (d, J = 2.9 Hz, 2H), 0.79 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 0.65 (d, J = 3.2 Hz, 2H), 0.44-0.40 (m, 2H), 0.14-0.06 (m, 2H); ESI MS (m/z): 413 [M+1].

[0682] 实例12:(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(异丙基)(甲基亚胺基)-λ⁶-硫烷酮((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(isopropyl)(methylimino)-λ⁶-sulfanone)407的合成

[0683]



[0684] 在除气且经搅拌的(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)(300mg,0.942mmol)的1,4-二恶烷(15mL)溶液中,加入醋酸铜(copper(II) acetate)(257mg,1.413mmol)、吡啶(0.183mL,2.262mmol)以及甲基硼酸(methylboronic acid)(282mg,4.71mmol)。所得混合物于回流条件下(100℃)搅拌16小时。反应完成后,于减压下除去1,4-二恶烷,且反应混合物以乙酸乙酯(60mL)稀释。有机层以水(3X20 mL)萃取、以盐水溶液(1X25 mL)清洗并以无水硫酸钠干燥。接着于减压下浓缩而得到粗固体物。粗材料进一步以制备级高效液相管柱层析纯化而得到所想要的2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(异丙基)(甲基亚胺基)-λ⁶-硫烷酮(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)

(isopropyl)(methylimino)-λ^6-sulfanone)407(175mg,0.526mmol,产率56%)。

[0685] 表12:本公开的代表性化合物依据实例12所描述的合适的起始物与方法制备。

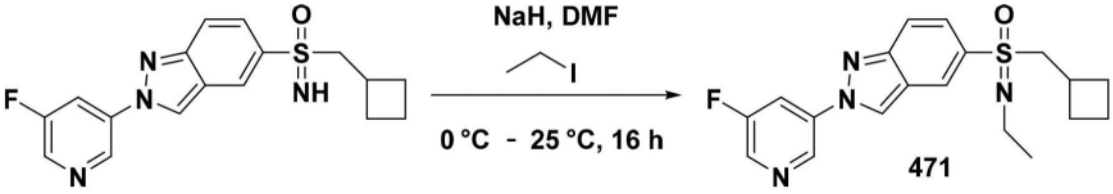
[0686]

化合物编号	化合物名称	分析数据
405	(环丙基亚胺基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(异丙基)-λ^6-硫烷酮 ((cyclopropylimino)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(isopropyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 3.44-3.38 (m, 1H), 2.33-2.28 (m, 1H), 1.24 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.07 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.41-0.34 (m, 2H), 0.32-0.21 (m, 2H); ESI MS (m/z): 358.55 [M+1].
406	(环丙基亚胺基)(异丙基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 ((cyclopropylimino)(isopropyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.46 (s, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.68 (q, J = 4.3 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.43-3.37 (m, 1H), 2.32-2.28 (m, 1H), 1.24 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.07 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 0.41-0.34 (m, 2H), 0.32-0.22 (m, 2H); ESI MS (m/z): 341.35 [M+1].
407	(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(异丙基)(甲基亚胺基)-λ^6-硫烷酮 ((2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(isopropyl)(methylimino)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.26 (q, J = 0.7 Hz, 1H), 8.75 (d, J = 3.1 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.31 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.93 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 3.43-3.36 (m, 1H), 2.53 (s, 3H), 1.25 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 1.10 (d, J = 7.0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 333.1 [M+1].
408	异丙基(甲基亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 (isopropyl(methylimino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.45 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.31 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.68 (ddd, J = 8.3, 4.6, 0.7 Hz, 1H), 7.56 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 3.42-3.35 (m, 1H), 2.53 (s, 3H), 1.26-1.22 (m, 3H), 1.11 (d, J = 6.8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 315.35 [M+1].
412	(环丙基亚胺基)(环丙基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 ((cyclopropylimino)(cyclopropylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.51 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.43 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.26 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 2.35-2.30 (m, 1H), 0.90-0.83 (m, 1H), 0.44-0.35 (m, 3H), 0.34-0.22 (m, 3H), 0.12 (td, J = 9.7, 4.8 Hz, 1H), -0.06 (dt, J = 14.9, 4.6 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 371 [M+1].
414	(环丙基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(甲基亚胺基)-λ^6-硫烷酮 ((cyclopropylmethyl)(2-(5-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.75 (q, J = 2.8 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.38 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz,

[0687]

	fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(methylimino)-λ⁶-sulfanone)	1H), 3.26-3.24 (m, 2H), 2.54 (s, 3H), 0.93-0.86 (m, 1H), 0.45-0.30 (m, 2H), 0.04 (dtd, J = 55.2, 9.6, 4.8 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 344.9 [M+1].
446	(环丙基亚胺基)(环丙基甲基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclopropylimino)(cyclopropylmethyl)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (s, 2H), 9.54-9.53 (m, 1H), 9.31 (s, 1H), 8.46 (s, 1H), 7.94 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 3.26 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 2.36-2.31 (m, 1H), 0.90-0.84 (m, 1H), 0.44-0.21 (m, 6H), 0.11 (td, J = 9.7, 4.8 Hz, 1H), -0.07 (td, J = 9.7, 4.9 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 354 [M+1].
447	(环丙基甲基)(甲基亚胺基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclopropylmethyl)(methylimino)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (d, J = 4.3 Hz, 2H), 9.52 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.31-9.29 (m, 1H), 8.40 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.93 (q, J = 4.7 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 3.27-3.24 (m, 2H), 2.53 (d, J = 3.7 Hz, 3H), 0.94-0.87 (m, 1H), 0.45-0.30 (m, 2H), 0.11 (td, J = 9.5, 4.9 Hz, 1H), -0.03 (td, J = 9.6, 4.8 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 328.1 [M+1].

[0688] 实例13:(环丁基甲基)(乙基亚胺基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮((cyclobutylmethyl)(ethylimino)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)471的合成

[0689] 

[0690] 在经搅拌的(环丁基甲基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(亚胺基)-λ⁶-硫烷酮((cyclobutylmethyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(imino)-λ⁶-sulfanone)(250mg,0.726mmol)的N,N-二甲基甲酰胺(6mL)溶液中,是于氮气气氛下在0℃加入氢化钠(60%分散于矿物油,58.1mg,1.452mmol),且所得混合物是于25℃搅拌15分钟。之后,冷却至0℃并于相同温度下加入1-碘乙烷(1-iodoethane)(0.117mL,1.452mmol)。所得反应混合物是于25℃搅拌16小时。反应完成后,反应物质是倒入水中,且水溶液层是以乙酸乙酯(3X20 mL)萃取。有机层是被分离,以无水硫酸钠干燥、过滤、并于减压浓缩而得到粗固体物。该粗材料是以制备级高效液相管柱层析纯化而得到所想要的((环丁基甲基)(乙基亚胺基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮((cyclobutylmethyl)(ethylimino)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)471(167mg,0.448mmol,产率62%)。

[0691] 表13:本公开的代表性化合物依据实例13所描述的合适的起始物与方法制备。

[0692]

化合物编号	化合物名称	分析数据
382	(乙基亚胺基)(异丙基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-λ⁶-硫烷酮 ((ethylimino)(isopropyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.16 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.69 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.51 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.66-7.60 (m, 2H), 7.54 (dd, J = 8.6, 7.0 Hz, 1H), 3.56-3.49 (m, 1H), 2.99-2.92 (m, 1H), 2.89-2.83 (m, 1H), 1.32 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 1.11-1.02 (m, 6H); ESI MS (m/z): 329.15 [M+1].
383	(乙基亚胺基)(异丙基)(2-(吡啶-3-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.45 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.8,

[0693]

	基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((ethylimino)(isopropyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1.3 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.32 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 8.3, 4.6 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 3.41-3.34 (m, 1H), 2.94-2.86 (m, 1H), 2.84-2.75 (m, 1H), 1.26-1.22 (m, 3H), 1.10-1.05 (m, 6H); ESI MS (m/z): 328.55 [M+1].
388	(环丙基甲基)(乙基亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclopropylmethyl)(ethylimino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.46 (s, 1H), 9.34 (s, 1H), 8.70 (d, J = 4.6 Hz, 1H), 8.50 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.91 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.70-7.64 (m, 2H), 3.24 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 2.94-2.79 (m, 2H), 1.07 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.87 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 0.43-0.38 (m, 1H), 0.33 (dd, J = 13.8, 4.5 Hz, 1H), 0.14-0.09 (m, 1H), -0.02--0.07 (m, 1H) ESI MS (m/z): 341.05 [M+1].
390	丁基(乙基亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (butyl(ethylimino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.45 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.36 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.70-7.66 (m, 1H), 7.62 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.27-3.21 (m, 2H), 2.93-2.85 (m, 1H), 2.81-2.72 (m, 1H), 1.63-1.52 (m, 1H), 1.50-1.39 (m, 1H), 1.34-1.25 (m, 2H), 1.10-1.04 (m, 3H), 0.86-0.77 (m, 3H); ESI MS (m/z): 343.1 [M+1].
391	乙基(乙基亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(ethylimino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.46 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.44-8.56 (1H), 8.35 (t, J = 0.9 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 2H), 3.26 (dd, J = 7.5, 5.7 Hz, 2H), 2.89 (s, 1H), 2.80 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 1.07 (td, J = 7.2, 5.4 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 315.05 [M+1].
397	(乙基亚胺基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮 ((ethylimino)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (s, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.7, 2.3 Hz, 1H), 8.32 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.39 (t, J = 6.8 Hz, 1H), 2.93-2.86 (m, 1H), 2.83-2.77 (m, 1H), 1.26 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.07 (dd, J = 13.0, 6.8 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 347 [M+1].
400	(乙基亚胺基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吡唑并[3,4-b]吡啶-5-基)(异丙基)-λ⁶-硫烷酮 ((ethylimino)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[3,4-b]pyridin-5-yl)(isopropyl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.52 (s, 1H), 9.29 (s, 1H), 8.90 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.79 (d, J = 2.2 Hz, 2H), 8.60 (dd, J = 9.8, 2.4 Hz, 1H), 3.50 (t, J = 6.7 Hz, 1H), 2.96-2.89 (m, 1H), 2.87-2.80 (m, 1H), 1.27 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.13 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.08 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 348 [M+1].
411	(环丙基甲基)(乙基亚胺基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclopropylmethyl)(ethylimino)(	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 8.38 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 3.24 (d, J = 7.3 Hz, 2H), 2.96-2.88 (m, 1H),

[0694]

	2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	2.86-2.77 (m, 1H), 1.07 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.91-0.85 (m, 1H), 0.45-0.38 (m, 1H), 0.35-0.29 (m, 1H), 0.11 (td, J = 9.6, 4.9 Hz, 1H), -0.05 (td, J = 9.9, 4.8 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 358.95 [M+1].
419	(乙基亚胺基)(异丙基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((ethylimino)(isopropyl)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.54 (s, 2H), 9.51 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.31 (s, 1H), 8.34 (t, J = 0.8 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.42-3.36 (m, 1H), 2.94-2.86 (m, 1H), 2.83-2.75 (m, 1H), 1.26-1.21 (m, 3H), 1.10-1.03 (m, 6H); ESI MS (m/z): 329.5 [M+1].
457	乙基(乙基亚胺基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(ethylimino)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (s, 2H), 9.52 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.31 (s, 1H), 8.38 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 3.30-3.23 (m, 2H), 2.92-2.86 (m, 1H), 2.83-2.76 (m, 1H), 1.07 (dd, J = 13.3, 7.2 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 316 [M+1].
461	乙基(乙基亚胺基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (ethyl(ethylimino)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.35 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 3.30-3.21 (m, 2H), 2.94-2.86 (m, 1H), 2.83-2.74 (m, 1H), 1.07 (q, J = 7.1 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 332.95 [M+1].
466	(环丁基甲基)(乙基亚胺基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclobutylmethyl)(ethylimino)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.55 (s, 2H), 9.51 (s, 1H), 9.31 (s, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.42 (td, J = 14.0, 7.2 Hz, 2H), 2.90-2.83 (m, 1H), 2.80-2.73 (m, 1H), 2.59 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 1.95-1.92 (m, 1H), 1.73-1.64 (m, 4H), 1.56-1.51 (m, 1H), 1.05 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 356.05 [M+1].
471	(环丁基甲基)(乙基亚胺基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclobutylmethyl)(ethylimino)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.05 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.68 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 8.59 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.13 (dt, J = 9.0, 2.4 Hz, 1H), 7.89 (dd, J = 9.2, 0.9 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 3.45-3.34 (m, 2H), 3.10-3.01 (m, 1H), 2.94-2.86 (m, 1H), 2.81-2.73 (m, 1H), 2.14-2.06 (m, 1H), 1.92-1.71 (m, 4H), 1.58-1.50 (m, 1H), 1.20 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 373.2 [M+1].
474	(乙基亚胺基)(甲基)(2-(嘧啶-5-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((ethylimino)(methyl)(2-(pyrimidin-5-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.38 (d, J = 3.4 Hz, 2H), 9.33 (s, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 7.96 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.25 (s, 3H), 3.12-3.02 (m, 1H), 2.92 (dt, J = 19.8, 7.0 Hz, 1H), 1.22 (q, J = 6.7 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 302.15 [M+1].
489	(乙基亚胺基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(丙基)-λ⁶-硫烷酮 ((ethylimino)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(propyl)-λ⁶-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.50 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 8.36 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 3.23 (t, J = 7.9 Hz, 2H), 2.93-2.85 (m, 1H),

[0695]

	sulfanone)	2.81-2.73 (m, 1H), 1.66-1.46 (m, 2H), 1.05 (t, J = 7.1 Hz, 3H), 0.87 (t, J = 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 346.95 [M+1].
490	仲丁基(乙基亚胺基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (sec-butyl(ethylimino)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.49 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.9, 2.4 Hz, 1H), 8.32 (s, 1H), 7.92 (dd, J = 9.0, 0.7 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.20-3.12 (m, 1H), 2.94-2.86 (m, 1H), 2.84-2.76 (m, 1H), 1.40-1.27 (m, 1H), 1.24 (d, J = 6.8 Hz, 2H), 1.09-1.05 (m, 5H), 0.89 (dt, J = 32.4, 7.5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361 [M+1].
491	(乙基亚胺基)(3-氟丙基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((ethylimino)(3-fluoropropyl)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.51 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.27 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.55 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 4.47 (dt, J = 47.1, 6.0 Hz, 2H), 3.38-3.33 (m, 2H), 2.95-2.76 (m, 2H), 2.04-1.84 (m, 2H), 1.07 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 364.9 [M+1].
492	(乙基亚胺基)(2-(5-氟吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(戊-3-基)-λ⁶-硫烷酮 ((ethylimino)(2-(5-fluoropyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(pentan-3-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.49 (s, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.75 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.54 (dt, J = 9.9, 2.3 Hz, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.92 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 3.06-3.00 (m, 1H), 2.89 (dt, J = 19.4, 7.2 Hz, 1H), 2.77 (dt, J = 19.4, 7.2 Hz, 1H), 1.98-1.90 (m, 1H), 1.79-1.68 (m, 2H), 1.54-1.46 (m, 1H), 1.07 (dd, J = 14.1, 6.7 Hz, 3H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.84 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 375 [M+1].
567	环丁基(乙基亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (cyclobutyl(ethylimino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.45 (dd, J = 7.0, 0.9 Hz, 1H), 9.33 (q, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.52-8.48 (m, 1H), 8.33 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.69-7.65 (m, 1H), 7.57 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 4.13-4.05 (m, 1H), 2.94-2.85 (m, 1H), 2.84-2.74 (m, 1H), 2.23-2.15 (m, 2H), 1.91-1.75 (m, 3H), 1.07-1.03 (m, 4H); ESI MS (m/z): 340.95 [M+1].
568	(环己基甲基)(乙基亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((cyclohexylmethyl)(ethylimino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.44 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.37 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.69-7.62 (m, 2H), 3.17 (dd, J = 6.0, 1.7 Hz, 2H), 2.85 (dd, J = 12.2, 7.3 Hz, 1H), 2.72 (dd, J = 12.2, 7.0 Hz, 1H), 1.84 (d, J = 3.1 Hz, 2H), 1.56 (d, J = 43.4 Hz, 4H), 1.09-1.02 (m, 8H) ESI MS (m/z): 383.05 [M+1].
585	(乙基亚胺基)(戊-3-基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((ethylimino)(pentan-3-yl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.44 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.2, 1.6 Hz, 1H), 3.05-2.99 (m, 1H), 2.93-2.85 (m, 1H), 2.81-2.73 (m, 1H), 1.94 (qd, J = 7.3, 4.6 Hz, 1H), 1.79-1.66 (m, 2H), 1.55-1.44 (m, 1H), 1.10-1.02 (m, 3H),

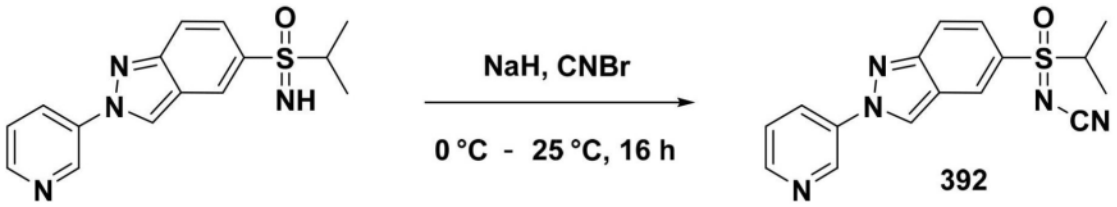
[0696]

		0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 0.84 (t, J = 7.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 357.05 [M+1].
586	环戊基(乙基亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (cyclopentyl(ethylimino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.44 (s, 1H), 9.33 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 8.50 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.92 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 3.77 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 2.91-2.84 (m, 1H), 2.76 (dt, J = 19.4, 7.1 Hz, 1H), 2.11 (dd, J = 13.4, 7.6 Hz, 1H), 1.94 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 1.73 (dd, J = 12.2, 7.0 Hz, 1H), 1.54 (dd, J = 15.3, 6.7 Hz, 4H), 1.48 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 1.04 (t, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 354.95 [M+1].
587	环庚基(乙基亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (cycloheptyl(ethylimino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.44 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 9.32 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.49 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.91 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.70-7.66 (m, 1H), 7.58 (dd, J = 9.0, 1.7 Hz, 1H), 3.28-3.23 (m, 1H), 2.94-2.85 (m, 1H), 2.82-2.74 (m, 1H), 2.30-2.23 (m, 1H), 1.97-1.91 (m, 1H), 1.68-1.59 (m, 3H), 1.54-1.31 (m, 7H), 1.05 (q, J = 7.2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 382.95 [M+1].
588	(2-环己基乙基)(乙基亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((2-cyclohexylethyl)(ethylimino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.45 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 8.35 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.2, 1.8 Hz, 1H), 3.28-3.23 (m, 2H), 2.91-2.84 (m, 1H), 2.81-2.74 (m, 1H), 1.59-1.47 (m, 6H), 1.36-1.30 (m, 1H), 1.24-1.20 (m, 1H), 1.11-1.01 (m, 6H), 0.77 (t, J = 10.5 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 397 [M+1].
589	(乙基亚胺基)(异丁基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 ((ethylimino)(isobutyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.45 (s, 1H), 9.33 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.70 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.51-8.49 (m, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 9.2, 1.5 Hz, 1H), 3.23-3.12 (m, 2H), 2.89-2.82 (m, 1H), 2.78-2.71 (m, 1H), 2.11-2.05 (m, 1H), 1.04 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.98 (d, J = 6.7 Hz, 3H), 0.87 (d, J = 6.7 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 343 [M+1].
595	环己基(乙基亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮 (cyclohexyl(ethylimino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.48 (s, 1H), 9.33 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.71 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.51 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.97 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.2, 4.8 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 9.3, 1.2 Hz, 1H), 3.62-3.58 (m, 1H), 2.00 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 1.35-1.11 (m, 6H), 0.83 (dt, J = 36.4, 7.2 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 369 [M+1].
597	(乙基亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)((四氢呋喃-2-基)甲基)-λ⁶-硫烷酮 ((ethylimino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.45 (dd, J = 6.1, 0.9 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.71-8.69 (m, 1H), 8.52-8.48 (m, 1H), 8.38-8.35 (m, 1H), 7.90 (q, J = 4.6 Hz, 1H), 7.69-7.62 (m, 2H), 4.14 (td, J = 6.2, 2.5 Hz, 1H), 3.54-3.40 (m, 5H),

[0697]

	yl)((tetrahydrofuran-2-yl)methyl)-λ^6-sulfanone)	2.93-2.73 (m, 2H), 1.77-1.68 (m, 2H), 1.63-1.48 (m, 1H), 1.09-1.03 (m, 3H) ESI MS (m/z): 370.95 [M+1].
603	4-(N-乙基-2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-磺酰亚胺酰)丁腈 (4-(N-ethyl-2-(pyridin-3-yl)-2H-indazole-5-sulfonimidoyl)butanenitrile)	1H-NMR (400 MHz, MeOD) δ 9.32 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 9.25 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.69 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.55-8.52 (m, 2H), 7.97-7.95 (m, 1H), 7.72-7.68 (m, 2H), 3.46-3.42 (m, 2H), 3.08-3.00 (m, 1H), 2.97-2.89 (m, 1H), 2.62 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.13-1.95 (m, 2H), 1.19 (t, J = 7.2 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 353.9 [M+1].
604	(乙基亚胺基)(异戊基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 ((ethylimino)(isopentyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.22 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.74-8.73 (m, 1H), 8.69 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.30 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.95-7.90 (m, 1H), 7.71 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 7.56-7.52 (m, 1H), 3.49-3.27 (m, 2H), 3.13-3.05 (m, 1H), 2.99-2.90 (m, 1H), 1.78-1.68 (m, 1H), 1.67-1.57 (m, 1H), 1.50-1.41 (m, 1H), 1.25-1.21 (m, 3H), 0.86 (dd, J = 8.7, 6.5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 357.05 [M+1].
612	(乙基亚胺基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)(3,3,3-三氟丙基)-λ^6-硫烷酮 ((ethylimino)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)(3,3,3-trifluoropropyl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, METHANOL-D4) δ 9.31 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.68 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.54-8.51 (m, 2H), 7.96 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.73-7.67 (m, 2H), 3.59-3.48 (m, 2H), 3.07-2.92 (m, 2H), 2.76-2.48 (m, 2H), 1.19 (t, J = 7.3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 382.9 [M+1].
615	(乙基亚胺基)(戊-2-基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 ((ethylimino)(pentan-2-yl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, CHLOROFORM-D) δ 9.22 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.73 (dd, J = 4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.65 (t, J = 1.2 Hz, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.32-8.29 (m, 1H), 7.90 (dd, J = 9.2, 1.2 Hz, 1H), 7.66 (dt, J = 9.2, 1.4 Hz, 1H), 7.54 (dd, J = 8.3, 4.9 Hz, 1H), 3.19-3.05 (m, 2H), 3.00-2.91 (m, 1H), 2.24-1.83 (m, 1H), 1.43-1.36 (m, 3H), 1.28-1.18 (m, 6H), 0.95-0.83 (m, 3H) ESI MS (m/z): 357.15 [M+1].
617	(乙基亚胺基)(丙基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 ((ethylimino)(propyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.46 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 9.33 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.50 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.35 (q, J = 0.8 Hz, 1H), 7.94-7.91 (m, 1H), 7.68 (ddd, J = 8.4, 4.7, 0.7 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 9.3, 1.7 Hz, 1H), 3.27-3.18 (m, 2H), 2.93-2.84 (m, 1H), 2.81-2.73 (m, 1H), 1.66-1.45 (m, 2H), 1.06 (t, J = 7.1 Hz, 3H), 0.87 (t, J = 7.5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 329.05 [M+1].
618	(乙基亚胺基)(新戊基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷酮 ((ethylimino)(neopentyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.59 (s, 1H), 9.36 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 8.79 (s, 1H), 8.74 (dd, J = 4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.53 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.82 (dd, J = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.71 (dd, J = 8.1, 4.4 Hz, 1H), 4.13 (d, J = 30.6 Hz, 2H), 3.10-2.94 (m, 2H), 1.11 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 1.03 (d, J = 14.9 Hz, 9H); ESI MS (m/z): 357.05 [M+1].

[0698] 实例14:N-(异丙基(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ^6-硫烷亚基)腈酰胺(N-(isopropyl(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ^6-sulfaneylidene)cyanamide)392的合成

[0699] 

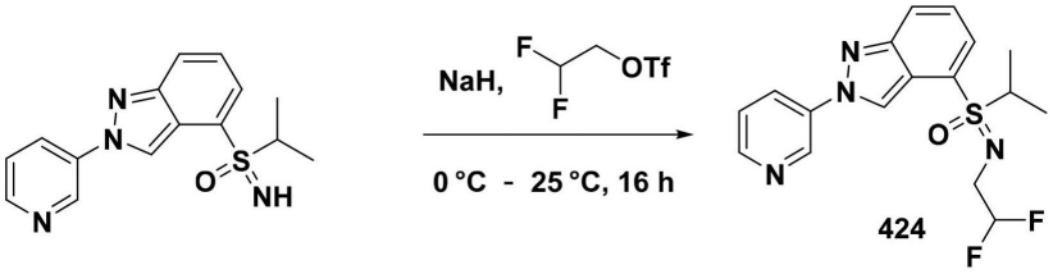
[0700] 在经搅拌的亚胺基(异丙基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷酮(imino(isopropyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfanone)(300 mg,0.999 mmol)的N,N-二甲基甲酰胺(5 mL)溶液中,于氮气气氛下在25℃加入氢化钠(59.9 mg,1.498 mmol),并继续搅拌5-10分钟。之后,反应混合物冷却至0℃并于此温度下且持续搅拌下加入溴化氰(cyanogen bromide)(159mg,1.498 mmol)。加入动作完成后,反应混合物被加温至25℃并于此温度搅拌12小时。反应完成后,反应混合物被倒入冰冷水中且水溶液层以乙酸乙酯(3X25 mL)萃取。有机层被分离、以盐水溶液(2X25 mL)清洗,以无水硫酸钠干燥、过滤并减压浓缩而得到粗油状物。粗材料以快速管柱层析法纯化而得到所想要的N-(异丙基(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)腈酰胺(N-(isopropyl(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)cyanamide)392(130 mg,0.400 mmol,产率40.0%)。

[0701] 表14:本公开的代表性化合物依据实例14所描述的合适的起始物与方法制备。

[0702]

化合物编号	化合物名称	分析数据
392	N-(异丙基(侧氧基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-5-基)-λ⁶-硫烷亚基)腈酰胺 (N-(isopropyl(oxo)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-5-yl)-λ⁶-sulfaneylidene)cyanamide)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.59 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 9.35 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.74 (dd, J = 4.6, 1.5 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.53 (dq, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.75-7.69 (m, 2H), 1.37 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 1.23 (d, J = 6.6 Hz, 4H); ESI MS (m/z): 325.5 [M+1].

[0703] 实例15:((2,2-二氟乙基)亚胺基)(异丙基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-λ⁶-硫烷酮(((2,2-difluoroethyl)imino)(isopropyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-λ⁶-sulfanone)424的合成

[0704] 

[0705] 在经搅拌的亚胺基(异丙基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-λ⁶-硫烷酮(imino(isopropyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-λ⁶-sulfanone)(300 mg,0.999 mmol)的N,N-二甲基甲酰胺(5 mL)溶液中,于氮气气氛下在25℃加入氢化钠(59.9 mg,1.498 mmol),并继续搅拌5-10分钟。之后,反应混合物冷却至0℃并于此温度下且持续搅拌下加入2,2-二氟乙基三氟甲磺酸酯(2,2-difluoroethyl trifluoromethanesulfonate)(662μl,4.99 mmol)。加入动作完成后,反应混合物被加温至25℃并于此温度搅拌16小时。反应完成后,反应混合物被倒入冰冷水中且水溶液层以乙酸乙酯(3X25 mL)萃取。有机层被

分离、以盐水溶液(2X25 mL)清洗,以无水硫酸钠干燥、过滤并减压浓缩而得到粗油状物。粗材料以快速管柱层析法纯化而得到所想要的((2,2-二氟乙基)亚胺基)(异丙基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-λ⁶-硫烷酮(((2,2-difluoroethyl)imino)(isopropyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-λ⁶-sulfanone)424(70mg,0.192mmol,产率19.23%)。

[0706] 表15:本公开的代表性化合物依据实例15所描述的合适的起始物与方法制备。

[0707]

化合物编号	化合物名称	分析数据
424	((2,2-二氟乙基)亚胺基)(异丙基)(2-(吡啶-3-基)-2H-吲唑-4-基)-λ⁶-硫烷酮 (((2,2-difluoroethyl)imino)(isopropyl)(2-(pyridin-3-yl)-2H-indazol-4-yl)-λ⁶-sulfanone)	1H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.36 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 9.23 (d, J = 0.5 Hz, 1H), 8.70 (dd, J = 4.6, 1.2 Hz, 1H), 8.55 (dq, J = 8.3, 1.3 Hz, 1H), 8.13-8.08 (m, 1H), 7.69-7.63 (m, 2H), 7.58 (dd, J = 8.6, 7.1 Hz, 1H), 6.01 (tt, J = 56.3, 4.2 Hz, 1H), 3.73-3.66 (m, 1H), 3.25-3.00 (m, 2H), 1.36-1.28 (m, 3H), 1.07 (d, J = 6.6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 364.95 [M+1].

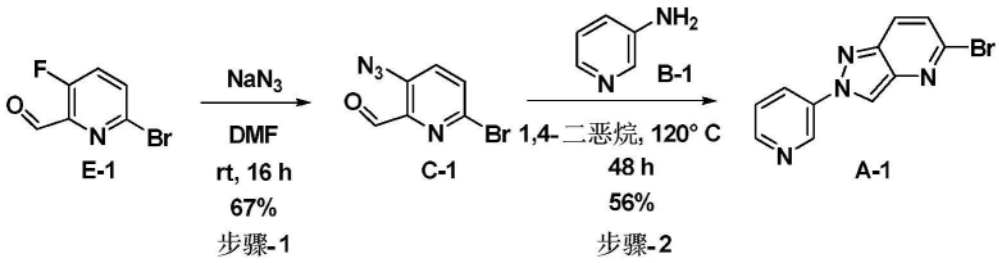
[0708] *化合物名称是以Chemdraw Professional 19.1产生

[0709] 式A-1、A-2或A-3化合物根据说明书中所述的一般流程6-14合成。尤其地,其中A_1、A_2及A_3表示C的式A-1化合物根据PCT专利公开号WO 201614435中所描述的步骤合成,其中A_1、A_2及A_3之一者表示N的式A-1化合物根据下述步骤合成。

[0710] 反应流程:

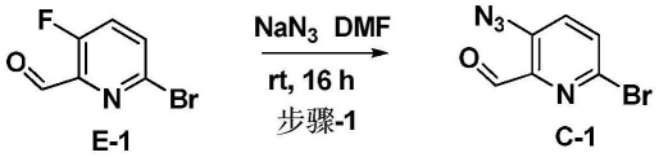
[0711] 实例-16:

[0712]



[0713] 3-迭氮-6-溴吡啶2-甲醛(3-azido-6-bromopicolinaldehyde):

[0714]



[0715] 在经搅拌的6-溴-3-氟吡啶2-甲醛(6-bromo-3-fluoropicolinaldehyde)E-1(8g,39.2mmol)的N,N-二甲基甲酰胺(80ml)溶液中,加入迭氮化钠(3.06g,47.1mmol),且所得混合物于25℃搅拌16小时。反应完成后,反应混合物以水稀释,且水溶液层以乙酸乙酯(3X100ml)萃取。有机层以盐水溶液(1X100ml)清洗•有机层以无水硫酸钠干燥、过滤并减压浓缩而得到3-迭氮-6-溴吡啶2-甲醛(3-azido-6-bromopicolinaldehyde)C-1(6g,26.4mmol,产率67.4%)。薄层层析片与真实点(authentic spot)比对。

[0716] 5-溴-2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶(5-bromo-2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridine):

[0717] 

[0718] 在经搅拌的3-迭氮-6-溴吡啶2-甲醛(3-azido-6-bromopicolinaldehyde)C-1(6g,26.4mmol)的1,4-二恶烷(60ml)溶液中,加入吡啶-3-胺(pyridin-3-amine)B-1(2.74g,29.1mmol),且所得混合物于120℃搅拌48小时。反应完成后,反应混合物于减压下浓缩并加入水而得到粗固体物,其再被过滤、收集且进一步以快速层析纯化而得到所想要的5-溴-2-(吡啶-3-基)-2H-吡唑并[4,3-b]吡啶(5-bromo-2-(pyridin-3-yl)-2H-pyrazolo[4,3-b]pyridine)A-1(4.1g,14.90mmol,产率56.4%)。

[0719] 如本文所述,式(I)的化合物显示出杀昆虫活性,该活性对攻击重要农作物的多种昆虫发挥作用。本发明化合物的活性如以下试验中所述评价:

[0720] 生物实例:

[0721] 实例A:烟草粉虱(Bemisia tabaci)

[0722] 使用浸叶法进行测试,其中称取所需量的化合物,并将其溶解在装有溶剂溶液的试管中。将试管置于2000rpm的涡流中以进行适当混合,接着,用0.01% Triton-X溶液将其稀释至所需的测试浓度。将茄子(brinjal)叶浸入化合物溶液中10秒,阴干20分钟,然后将叶片的背轴(abaxial)侧朝上地放置在分别装有4ml的固化的1%洋菜-洋菜溶液的有孔容器盖上。通过改良的抽吸器,收集已知数量的刚孵化的粉虱(whitefly)成虫,并将其释放到一个有孔容器中,该容器的盖子装有经处理的叶子。将容器存放在温度为25℃及相对湿度为70%的植物生长腔体中。在成虫释放72小时后,记录死亡、垂死及存活的成虫。所计算的死亡率百分比是通过结合死亡及垂死的成虫的死亡率百分比而得,并将其与未处理的其中之一进行比对。以下所记录的化合物,于300ppm时具有大于或等于70%的死亡率:1、9、11、18、25、28、29、30、31、32、33、34、38、43、48、65、66、68、71、72、73、74、77、78、79、86、87、93、101、104、108、109、110、116、119、122、123、124、126、135、184、186、193、213、214、215、216、218、219、220、221、222、223、224、226、227、228、231、236、237、238、239、240、241、248、249、250、254、255、278、287、288、289、290、291、292、293、294、296、306、307、308、309、310、311、312、313、314、337、354、355、358、368、369、383、385、386、387、389、391、397、406、408、410、418、419、421、446、447、450、455、457、458、461、462、463、465、466、467、470、474、475、478、479、480、482、554、557、561以及580。

[0723] 实例B:桃蚜(Myzus persicae)

[0724] 使用浸叶法进行测试,其中称取所需量的化合物,并将其溶解在装有溶剂溶液的试管中。将试管置于2000rpm的涡流中以进行适当混合,接着,用0.01% Triton-X溶液将其稀释至所需的测试浓度。将辣椒(capsicum)叶浸入化合物溶液中10秒,阴干20分钟,然后将叶片的背轴侧朝上放置在分别装有4ml的固化的1%洋菜-洋菜溶液的生物测定盘上。收集在培养皿中的已知数量的桃蚜的第三龄若虫,并将其释放到具有经处理的叶子的单元中,该单元是用有孔的盖子覆盖以更良好地透气。将测定盘存放在温度为25℃及相对湿度为70%的植物生长腔体中。在若虫释放72小时后,记录死亡、垂死及存活的若虫。所计算的死

亡率百分比是通过结合死亡及垂死的若虫的死亡率百分比而得,并将其与未处理的其中之一进行比对。以下所记录的化合物,于300ppm时具有大于或等于70％的死亡率:1、2、3、25、28、29、32、41、64、70、71、73、88、89、90、92、99、102、110、112、119、123、124、136、137、138、146、147、148、156、168、180、193、216、217、218、224、236、237、238、239、240、248、249、250、254、255、256、287、288、290、291、306、312、314、337、354、383、386、387、388、389、390、397、406、419、455、456、457、458、460、461、478、479、480、482、483、484、485、486、487、488、490、491、492、557、558、560、564、567、569以及581。

[0725] 实例C:褐稻虱(Nilaparvata lugens)

[0726] 使用浸苗法(seedling dip method)进行测试,其中称取所需量的化合物,并将其溶解在装有溶剂溶液的试管中。将试管置于2000rpm的涡流中以进行适当混合,接着,用0.01％Triton-X溶液将其稀释至所需的测试浓度。将水稻(paddy)幼苗浸入化合物溶液中10秒,阴干20分钟,然后将幼苗置于玻璃试管中并使根部保持在水中。将15只褐稻虱的第三龄若虫释放到各测试试管中,并将试管存放在温度为25℃及相对湿度为75％的植物生长腔体中。在若虫释放72小时后,记录死亡、垂死及存活的若虫。所计算的死亡率百分比是通过结合死亡及垂死的若虫的死亡率百分比而得,并将其与未处理的其中之一进行比对。以下所记录的化合物,于300ppm时具有大于或等于70％的死亡率:1、2、3、4、5、7、8、9、11、12、13、14、16、19、20、21、23、26、27、28、29、30、32、33、38、41、42、51、64、71、72、73、78、86、87、92、93、104、105、111、112、113、114、115、125、126、127、137、146、147、148、152、153、155、181、193、194、202、206、236、238、240、331、337、343、347、354、355、356、357、358、359、360、367、385、386、387、388、389、391、392、394、396、397、402、406、417、419、446、447、450、454、457、461、462、464、470、471、474以及475。

[0727] 已经参照某些较佳实施方式描述本发明,从说明书考虑,其他实施方式对于本领域技术人员将变得显而易见。