



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 109890793 B

(45) 授权公告日 2022. 11. 18

(21) 申请号 201780069050.7

(22) 申请日 2017.11.06

(65) 同一申请的已公布的文献号
申请公布号 CN 109890793 A

(43) 申请公布日 2019.06.14

(30) 优先权数据
16198550.2 2016.11.11 EP

(85) PCT国际申请进入国家阶段日
2019.05.08

(86) PCT国际申请的申请数据
PCT/EP2017/078319 2017.11.06

(87) PCT国际申请的公布数据
W02018/087036 EN 2018.05.17

(73) 专利权人 拜耳动物保健有限责任公司
地址 德国莱沃库森

(72) 发明人 W. 霍伊布施 J. 克伯林 A. 克勒
H-G. 施瓦茨 D. 库尔克 C. 韦尔茨
T. 伊尔格 K. 伯恩根 庄伟

N. 格里贝诺夫 C. 伯姆 N. 林德纳
M. 欣克 U. 格根斯

(74) 专利代理机构 中国专利代理(香港)有限公司
72001
专利代理师 刘维升 万雪松

(51) Int. Cl.
C07D 215/54 (2006.01)
C07D 215/56 (2006.01)
C07D 405/12 (2006.01)
C07D 405/14 (2006.01)
A61K 31/47 (2006.01)
A61P 33/10 (2006.01)

(56) 对比文件
US 4343804 A, 1982.08.10
CN 102574817 A, 2012.07.11
CN 104995193 A, 2015.10.21
AU 2014356673 A1, 2016.06.16

审查员 王俊

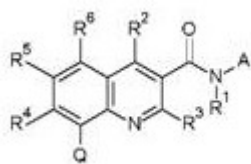
权利要求书36页 说明书315页

(54) 发明名称

新的抗蠕虫药喹啉-3-甲酰胺衍生物

(57) 摘要

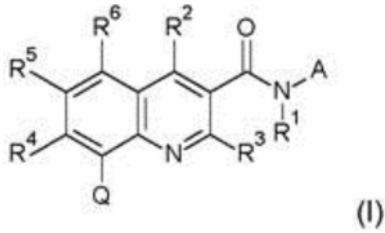
本发明涉及新的通式 (I) 的喹啉化合物:



(I) 其中A、R¹、R²、R³、R⁴、

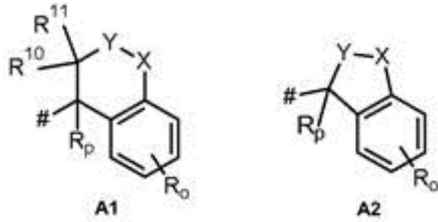
R⁵、R⁶、和Q如本文中所定义,涉及制备所述化合物的方法,用于制备所述化合物的中间体化合物,包含所述化合物的药物组合物和组合,以及所述化合物在制备用于治疗、控制和/或预防疾病,特别是蠕虫感染的药物组合物中的用途,作为唯一的药剂或与其它活性成分组合。

1. 通式 (I) 的化合物:



其中:

A 是 A1 或 A2,



o 是 0、1、2、3 或 4,

R 选自氢、卤素、氰基、硝基、-OH、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 个卤素原子的 C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有 1 至 5 个卤素原子的 C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 个卤素原子的 -S-C₁-C₄-卤代烷基、具有 1 至 5 个卤素原子的 -S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有 1 至 5 个卤素原子的 -SO₂-C₁-C₄-卤代烷基,

R_p 选自氢、C₁-C₄-烷基,

X、Y 独立地选自 CR⁷R⁸、O、S 和 N-R⁹, 其中 X 和 Y 中的至少一个是 CR⁷R⁸, 或

X、Y 一起形成选自以下的环成员: -C(O)-O-、-C(O)-NR⁹-、-S(O)-NR⁹-、-SO₂-NR⁹- 和 -SO₂-O-

R¹ 选自氢、氰基、-CHO、-OH、C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 个卤素原子的 C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有 1 至 5 个卤素原子的 C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、具有 1 至 5 个卤素原子的 C₃-C₆-卤代环烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₃-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、-NH-C₁-C₄-烷基、-N(C₁-C₄-烷基)₂、NH₂-C₁-C₄-烷基、-C₁-C₄-烷基-NH-C₁-C₄-烷基、(C₁-C₄-烷基)₂N-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基-C(O)-、具有 1 至 5 个卤素原子的 C₁-C₄-卤代烷基-C(O)-、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、苄氧基-C(O)-、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基-C(O)-、-SO₂-C₁-C₄-烷基和具有 1 至 5 个卤素原子的 -SO₂-C₁-C₄-卤代烷基;

苯基-C₁-C₄-烷基, 任选地被 1、2、3、4 或 5 个独立地选自以下的取代基取代: 卤素、-OH、-NO₂、氰基、具有 1 至 5 个卤素原子的 C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有 1 至 5 个卤素原子的 C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有 1 至 5 个卤素原子的 -S-C₁-C₄-卤代烷基、具有 1 至 5 个卤素原子的 -S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有 1 至 5 个卤素原子的 -SO₂-C₁-C₄-卤代烷基;

杂环基-C₁-C₄-烷基, 其中所述杂环基取代基选自 4-至 10-元杂环烷基、5-元杂芳基和 6-元杂芳基, 其各自任选地被 1、2 或 3 个独立地选自以下的取代基取代: 卤素、-OH、-NO₂、氰基、具有 1 至 5 个卤素原子的 C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有 1 至 5 个卤素原子的 C₁-C₄-卤代

烷氧基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{S}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-\text{S}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ 和具有1至5个卤素原子的 $-\text{SO}_2-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ ，

R^2 选自

氢、卤素、氰基、 $-\text{COOH}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷氧基}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})_2$ ；

$-\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$ ；

$-\text{OR}^{14}$ ；

$-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^{15}$ ；

$\text{C}_1\text{-C}_6\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-环烷基}$ 、 $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-烯基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-环烯基}$ 、 $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-炔基}$ 或苯基- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ ，其各自任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、氰基、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷氧基}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})_2$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷氧基}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})(\text{C}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{S}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-\text{S}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ 和具有1至5个卤素原子的 $-\text{SO}_2-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ ；

杂环基- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ ，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、氰基、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷氧基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷氧基}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{S}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-\text{S}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ 和具有1至5个卤素原子的 $-\text{SO}_2-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ ；

苯基，其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷氧基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷氧基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-环烷基}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{S}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-\text{S}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ 和具有1至5个卤素原子的 $-\text{SO}_2-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ ；和

选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、杂螺环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、 $-\text{OH}$ 、氧代、硫羰基、 $-\text{COOH}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷氧基}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})_2$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、 $-\text{C}(\text{O})-$ 、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷氧基}$ 、羟基- $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷氧基}$ - $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷氧基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-环烷基}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{S}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-\text{S}-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-\text{SO}_2-\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基}$ 和4-至10-元杂环烷基，

R^3 是氢或 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ ，

R^4 选自氢、卤素、 $-\text{OH}$ 、氰基、 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-环烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤$

代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷基-C(O)-、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{-烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{-烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4\text{-烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{-烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{-烷基}$ ，

R^5 选自氢、卤素、 $-OH$ 、氰基、 C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷基-C(O)-、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{-烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{-烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4\text{-烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{-烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{-烷基}$ ，

R^6 选自氢、卤素、 $-OH$ 、氰基、 C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷基-C(O)-、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{-烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{-烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4\text{-烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{-烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{-烷基}$ ，

R^7 选自氢、 $-OH$ 、氟、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，

R^8 选自氢、 $-OH$ 、氟、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，

或者 R^7 和 R^8 一起形成氧代基团(=O)，

或者 R^7 和 R^8 与它们所连接的碳原子一起形成选自以下的3-至6-元环： C_3-C_6 -环烷基和3-至6-元杂环烷基，

R^9 选自氢、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，

R^{10} 选自氢、 $-OH$ 、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，

R^{11} 选自氢、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，

或者 R^{10} 和 R^{11} 与它们所连接的碳原子一起形成选自以下的3-至6-元环： C_3-C_6 -环烷基和3-至6-元杂环烷基，

R^{12} 和 R^{13} 独立地选自

氢、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{-烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{-烷基})_2$ 、 $-NH(-C(O)-C_1-C_4\text{-烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{-烷基})(-C(O)-C_1-C_4\text{-烷基})$ 、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-；

C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-OH$ 、氰基、 $-COOH$ 、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4\text{-烷基})$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4\text{-烷基})_2$ 、 $-NH-C(O)-C_1-C_4\text{-烷基}$ 、 $-N(C_1-C_4\text{-烷基})(-C(O)-C_1-C_4\text{-烷基})$ 、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{-烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{-烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4\text{-烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{-烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{-烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4\text{-卤代烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4\text{-卤代烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4\text{-卤代烷基}$ 和 $(C_1-C_4\text{-烷氧基})_2P(=O)-$ ；

杂环基- C_1-C_4 -烷基，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、 $-OH$ 、氧代、硫羰基、 $-COOH$ 、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4\text{-烷基})$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4\text{-烷基})_2$ 、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羟基- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4\text{-烷基})$ 、 $-N(C_1-C_4\text{-烷基})_2$ 、 $-S-C_1-C_4\text{-烷基}$ 、 $-S(O)-C_1-C_4\text{-烷基}$ 、 $-SO_2-C_1-C_4\text{-烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4\text{-卤代烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4\text{-卤代烷基}$ 和具有1至5个卤素原

子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；

苯基、苯并-C₅-C₆-环烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；

选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、羟基-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基，

R¹⁴选自

-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂；

C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、苯基-C₁-C₄-烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、-OH、氰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；

杂环基-C₁-C₄-烷基，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、羟基-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；

苯基，其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；和

选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-

COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C_1-C_4 -烷基)、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羟基- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基，

R¹⁵选自

氢；

C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、-OH、氰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C_1-C_4 -烷基)、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基；

杂环基- C_1-C_4 -烷基，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C_1-C_4 -烷基)、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羟基- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基；

苯基，其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基；和

选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C_1-C_4 -烷基)、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羟基- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基，

Q选自6-或10-元芳基和5-至10-元杂芳基，其各自任选地被1、2、3、4或5个选自以下的取代基取代：卤素、SF₅、氰基、-CHO、硝基、氧代、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -羟基烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、羟基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_4 -烷氧基、氰基- C_1-C_4 -烷

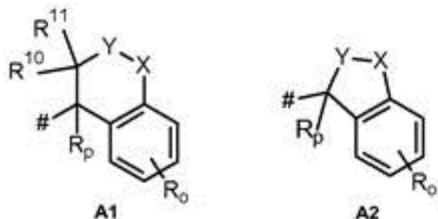
氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-NH-SO_2-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(SO_2-[C_1-C_4-烷基])(C_1-C_4-烷基)$ 、 $(C_1-C_4-烷氧基亚氨基)-C_1-C_4-烷基$ 、任选地被1或2个选自氟、氯、溴、甲基和氰基的取代基取代的4-至6-元杂环基、 $-CH_2-O-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-CH_2-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-CH_2-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、被4-至6-元杂环基取代的甲基、所述4-至6-元杂环基本身任选地被1或2个选自氟、氯、溴、甲基和氰基的取代基取代、 $-CH_2-S-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-CH_2-S(O)-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-CH_2-SO_2-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-S-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-S(O)-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-SO_2-(C_1-C_4-烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-(C_1-C_4-卤代烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-(C_1-C_4-卤代烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-(C_1-C_4-卤代烷基)$ 、 $-CONH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-CONH(C_3-C_6-环烷基)$ 、 $-NHC(O)(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-NHC(O)(C_3-C_6-环烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-NHC(O)(C_1-C_4-卤代烷基)$ ，

其中当Y是O、S或 $N-R^9$ 时， R^7 、 R^8 、 R^{10} 和 R^{11} 中没有一个是-OH，并且其中当X是O、S或 $N-R^9$ 时， R^7 和 R^8 中没有一个是-OH，

或其立体异构体、互变异构体或盐、或者它们的混合物。

2. 根据权利要求1所述的化合物，其中：

A是A1或A2，



o是0、1、2、3或4，

R选自氢、卤素、氰基、硝基、-OH、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4-卤代烷基$ 和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4-卤代烷基$ ，

R_p 选自氢、 C_1-C_4 -烷基，

X、Y独立地选自 CR^7R^8 、O、S和 $N-R^9$ ，其中X和Y中的至少一个是 CR^7R^8 ，或

X、Y一起形成选自以下的环成员： $-C(O)-O-$ 、 $-C(O)-NR^9-$ 、 $-S(O)-NR^9-$ 、 $-SO_2-NR^9-$ 和 $-SO_2-O-$ ，

R^1 选自氢、氰基、-CHO、-OH、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、具有1至5个卤素原子的 C_3-C_6 -卤代环烷基、 C_3-C_4 -烯基、 C_3-C_4 -炔基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_3 -烷基、氰基- C_1-C_4 -烷基、 $-NH-C_1-C_4-烷基$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $NH_2-C_1-C_4-烷基$ 、 $-C_1-C_4-烷基-NH-C_1-C_4-烷基$ 、 $(C_1-C_4-烷基)_2N-C_1-C_4-烷基$ 、 $C_1-C_4-烷基-C(O)-$ 、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基- $C(O)-$ 、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、苄氧基- $C(O)-$ 、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基- $C(O)-$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4-卤代烷基$ ；

苯基- C_1-C_4 -烷基，任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代：卤素、-OH、 NO_2 、氰基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的

C_1-C_4 -卤代烷氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4-卤代烷基$ 和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4-卤代烷基$ ；

杂环基- $C_1-C_4-烷基$ ，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、氰基、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷基$ 、 $C_1-C_4-烷氧基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷氧基$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4-卤代烷基$ 和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4-卤代烷基$ ，

R^2 选自

氢、卤素、氰基、 $-COOH$ 、 $C_1-C_4-烷氧基-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ ；

$-NR^{12}R^{13}$ ；

$-OR^{14}$ ；

$-SR^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-SO_2R^{15}$ ；

$C_1-C_6-烷基$ 、 $C_3-C_6-环烷基$ 、 $C_2-C_4-烯基$ 、 $C_3-C_6-环烯基$ 、 $C_2-C_4-炔基$ 或苯基- $C_1-C_4-烷基$ ，其各自任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、氰基、 $C_1-C_4-烷基-C(O)-$ 、 $C_1-C_4-烷氧基-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷基$ 、 $C_1-C_4-烷氧基$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-NH(C(O)-C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)(C(O)-C_1-C_4-烷基)$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4-卤代烷基$ 和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4-卤代烷基$ ；

杂环基- $C_1-C_4-烷基$ ，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、氰基、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷基$ 、 $C_1-C_4-烷氧基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷氧基$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4-卤代烷基$ 和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4-卤代烷基$ ；

苯基，其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、 $-OH$ 、 $C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷基$ 、 $C_1-C_4-烷氧基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷氧基$ 、 $C_3-C_6-环烷基$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4-卤代烷基$ 和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4-卤代烷基$ ；和

选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、杂螺环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、 $-OH$ 、氧代、硫羰基、 $-COOH$ 、 $C_1-C_4-烷氧基-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $C_1-C_4-烷基$ 、 $C_1-C_4-烷基-C(O)-$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷基$ 、 $C_1-C_4-烷氧基$ 、羟基- $C_1-C_4-烷基$ 、 $C_1-C_4-烷氧基-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷$

氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4-卤代烷基$ 和4-至10-元杂环烷基，

R^3 是氢或 $C_1-C_4-烷基$ ，

R^4 选自氢、卤素、 $-OH$ 、氰基、 $C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷基$ 、 $C_1-C_4-烷氧基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷氧基$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ ，

R^5 选自氢、卤素、 $-OH$ 、氰基、 $C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷基$ 、 $C_1-C_4-烷氧基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷氧基$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ ，

R^6 选自氢、卤素、 $-OH$ 、氰基、 $C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷基$ 、 $C_1-C_4-烷氧基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷氧基$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ ，

R^7 选自氢、 $-OH$ 、氟、 $C_1-C_4-烷基$ 和 $C_1-C_4-烷氧基$ ，

R^8 选自氢、 $-OH$ 、氟、 $C_1-C_4-烷基$ 和 $C_1-C_4-烷氧基$ ，

或者 R^7 和 R^8 一起形成氧代基团(=O)，

R^9 选自氢、 $C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷基$ 和 $C_1-C_4-烷氧基$ ，

R^{10} 选自氢、 $-OH$ 、 $C_1-C_4-烷基$ 和 $C_1-C_4-烷氧基$ ，

R^{11} 选自氢、 $C_1-C_4-烷基$ 和 $C_1-C_4-烷氧基$ ，

R^{12} 和 R^{13} 独立地选自

氢、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-NH(-C(O)-C_1-C_4-烷基)$ 、 $C_1-C_4-烷氧基$ ；

$C_1-C_4-烷基$ 、 $C_3-C_6-环烷基$ 、苯基- $C_1-C_4-烷基$ ，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-OH$ 、氰基、 $-COOH$ 、 $C_1-C_4-烷氧基$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-NH-C(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)-(-C(O)-C_1-C_4-烷基)$ 、 $C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷基$ 、 $C_1-C_4-烷氧基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷氧基$ 、 $C_3-C_6-环烷基$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4-卤代烷基$ 和 $(C_1-C_4-烷氧基)_2P(=O)-$ ；

杂环基- $C_1-C_4-烷基$ ，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、 $-OH$ 、氧代、硫羰基、 $-COOH$ 、 $C_1-C_4-烷氧基$ 、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷基$ 、 $C_1-C_4-烷氧基$ 、羟基- $C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷氧基$ 、 $C_3-C_6-环烷基$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4-卤代烷基$ 和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4-卤代烷基$ ；

苯基、苯并- $C_5-C_6-环烷基$ ，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、 $-OH$ 、 $C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷基$ 、 $C_1-C_4-烷氧基$ 、具有1至5个卤素原子的 $C_1-C_4-卤代烷氧基$ 、 $C_3-C_6-环烷基$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷$

基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；和

选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、羟基-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基，

R¹⁴选自

-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂；

C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、苯基-C₁-C₄-烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、-OH、氰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；

杂环基-C₁-C₄-烷基，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、羟基-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；

苯基，其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；和

选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、羟基-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷

基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基，

R¹⁵选自

氢；

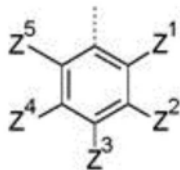
C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、苯基-C₁-C₄-烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、-OH、氰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；

杂环基-C₁-C₄-烷基，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、羟基-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；

苯基，其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；和

选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、羟基-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基，

Q是式(Q1)的取代的苯基环



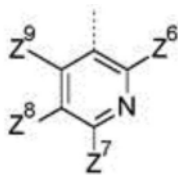
(Q1)

其中：

Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 Z^4 和 Z^5 独立地选自氢、卤素、 SF_5 、氰基、-CHO、硝基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、羟基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷氧基、氰基- C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、-NH-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基)、-N(SO₂-[C_1 - C_4 -烷基])(C_1 - C_4 -烷基)、(C_1 - C_4 -烷氧基亚氨基)- C_1 - C_4 -烷基、任选地被1或2个选自氟、氯、溴、甲基和氰基的取代基取代的4-至6-元杂环基、-CH₂-O-(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、被4-至6-元杂环基取代的甲基,所述4-至6-元杂环基本身任选地被1或2个选自氟、氯、溴、甲基和氰基的取代基取代、-CH₂-S-(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-S(O)-(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基)、-S-(C_1 - C_4 -烷基)、-S(O)-(C_1 - C_4 -烷基)、-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基)、具有1至5个卤素原子的-S-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-S(O)-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-SO₂-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、-CONH(C_1 - C_4 -烷基)、-CONH(C_3 - C_6 -环烷基)、-NHC(O)(C_1 - C_4 -烷基)、-NHC(O)(C_3 - C_6 -环烷基)、具有1至5个卤素原子的-NHC(O)(C_1 - C_4 -卤代烷基),或 Z^1 和 Z^2 与它们所连接的碳原子一起形成5-或6-元的饱和的或部分饱和的杂环、5-元杂芳基或6-元杂芳基,其各自可任选地被一个或两个选自下述的取代基取代:甲基、氟和氧代,和

Z^3 、 Z^4 和 Z^5 独立地选自氢、卤素、 SF_5 、氰基、CHO、硝基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、羟基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷氧基、氰基- C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基-C(O)-、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、-NH-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基)、-N(SO₂-[C_1 - C_4 -烷基])(C_1 - C_4 -烷基)、(C_1 - C_4 -烷氧基亚氨基)- C_1 - C_4 -烷基、任选地被1或2个选自氟、甲基或氰基的取代基取代的4-至6-元杂环烷基、-CH₂-O-(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、被4-至6-元杂环烷基取代的甲基,所述4-至6-元杂环烷基本身任选地被1或2个选自氟、甲基或氰基的取代基取代、-CH₂-S-(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-S(O)-(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基)、-S-(C_1 - C_4 -烷基)、-S(O)-(C_1 - C_4 -烷基)、-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基)、具有1至5个卤素原子的-S-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-S(O)-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-SO₂-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、-CONH(C_1 - C_4 -烷基)、-CONH(C_3 - C_6 -环烷基)、-NHC(O)(C_1 - C_4 -烷基)、-NHC(O)(C_3 - C_6 -环烷基)、具有1至5个卤素原子的-NHC(O)(C_1 - C_4 -卤代烷基),或 Z^2 和 Z^3 与它们所连接的碳原子一起形成5-或6-元的饱和的或部分饱和的杂环、5-元杂芳基或6-元杂芳基,其各自可任选地被一个或两个选自下述的取代基取代:甲基、氟和氧代,和 Z^1 、 Z^4 和 Z^5 独立地选自氢、卤素、 SF_5 、氰基、CHO、硝基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、羟基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷氧基、氰基- C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、-NH-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基)、-N(SO₂-[C_1 - C_4 -烷基])(C_1 - C_4 -烷基)、(C_1 - C_4 -烷氧基亚氨基)- C_1 - C_4 -烷基、任选地被1或2个选自氟、甲基或氰基的取代基取代的4-至6-元杂环烷基、-CH₂-O-(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、被4-至6-元杂环烷基取代的甲基,所述4-至6-元杂环烷基本身任选地被1或2个选自氟、甲基或氰基的取代基取代、-CH₂-S-(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-S(O)-(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基)、-S-(C_1 - C_4 -烷基)、-S(O)-(C_1 - C_4 -烷基)、-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基)、具有1至5个卤素原子的-S-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-S(O)-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-SO₂-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、-CONH(C_1 - C_4 -烷基)、-CONH(C_3 - C_6 -环烷基)、-NHC(O)(C_1 - C_4 -烷基)、-NHC(O)(C_3 - C_6 -环烷基)、具有1至5个卤素原子的-NHC(O)(C_1 - C_4 -卤代烷基),

或Q是式 (Q2) 的吡啶环

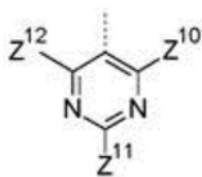


(Q2)

其中:

Z⁶、Z⁷、Z⁸和Z⁹独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂,或

Q是式 (Q3) 的嘧啶环

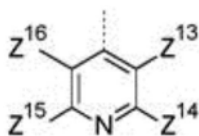


(Q3)

其中:

Z¹⁰、Z¹¹和Z¹²独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂,或

Q是式 (Q4) 的吡啶环

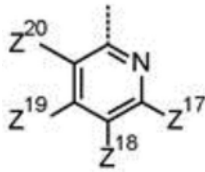


(Q4)

其中:

Z¹³、Z¹⁴、Z¹⁵和Z¹⁶独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-羟基烷基、NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-NH-CO-C₁-C₄-烷基、和选自下述的单环杂环: 4-至7-元杂环烷基或具有至少一个氮原子的5-元杂芳基, 所述杂芳基环通过该氮原子与所述吡啶环相连, 其各自任选地被1、2或3个独立地选自下述的取代基取代: 卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(0)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-(C₁-C₄-卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-S(0)-(C₁-C₄-卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-SO₂-(C₁-C₄-卤代烷基),或

Q是式(Q5)的吡啶环



(Q5)

其中:

Z¹⁷、Z¹⁸、Z¹⁹和Z²⁰独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂,或

Q是式(Q6)的5元芳族杂环



(Q6)

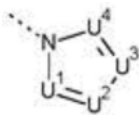
其中:

T¹-T⁴独立地选自N、O、S、C-Z²¹和N-Z²²,其中T¹-T⁴中不超过一个是O、T¹-T⁴中不超过一个是S、T¹-T⁴中不超过一个是N-Z²²,并且其中

每个Z²¹独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基,和

每个Z²²独立地选自氢、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷基-C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基,或

Q是式(Q7)的5元芳族杂环



(Q7)

其中:

U¹-U⁴独立地选自N和C-Z²³,其中U¹-U⁴中不超过三个是N,并且其中

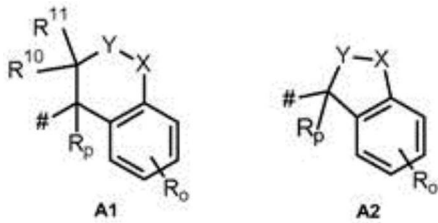
每个Z²³独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基,

其中当Y是O、S或N-R⁹时,R⁷、R⁸、R¹⁰和R¹¹中没有一个是-OH,并且其中当X是O、S或N-R⁹时,R⁷和R⁸中没有一个是-OH,

或其立体异构体、互变异构体或盐,或者它们的混合物。

3. 根据权利要求1或2所述的化合物,其中:

A是A1或A2,



o是0、1或2，

R选自卤素、C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-烷氧基、氰基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基，

R_p选自氢、C₁-C₄-烷基，

X、Y独立地选自CR⁷R⁸、O、S和N-R⁹，其中X和Y中的至少一个是CR⁷R⁸，

R¹选自氢、C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₃-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基，

R²选自

氢、卤素、氰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂；

-NR¹²R¹³；

-OR¹⁴；

-SR¹⁵、-S(O)R¹⁵、-SO₂R¹⁵；

C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₂-C₄-烯基、C₃-C₆-环烯基、C₂-C₄-炔基或苯基-C₁-C₄-烷基，其各自任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代：卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-NH(C(O)-C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)(C(O)-C₁-C₄-烷基)、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；和

选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、杂螺环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、-OH、氧代、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基-C(O)-、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、羟基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基-、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂和4-至10-元杂环烷基，R³是氢或C₁-C₄-烷基，

R⁴选自氢、卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂，

R⁵选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂，

R⁶选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂，

R⁷选自氢和C₁-C₄-烷基，

R⁸选自氢和C₁-C₄-烷基，

或者 R^7 和 R^8 一起形成氧代基团(=O),

R^9 是 C_1-C_4 -烷基,

R^{10} 选自氢、-OH、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基,

R^{11} 是氢,

R^{12} 和 R^{13} 独立地选自

氢、-NH(-C(O)- C_1-C_4 -烷基)、 C_1-C_4 -烷氧基;

C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C_1-C_4 -烷基)、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-NH-C(O)- C_1-C_4 -烷基、-N(C_1-C_4 -烷基)-(-C(O)- C_1-C_4 -烷基)、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基和(C_1-C_4 -烷氧基)₂P(=O)-;

杂环基- C_1-C_4 -烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、-OH、氧代、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基;

苯基、苯并- C_5-C_6 -环烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基;和

选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、-OH、氧代、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基,

R^{14} 选自

C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基;和

杂环基- C_1-C_4 -烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、-OH、氧代、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基;

R^{15} 选自

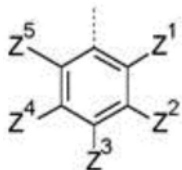
氢;

C_1-C_4 -烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基;

杂环基- C_1-C_4 -烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-

元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基;

Q是式(Q1)的取代的苯基环



(Q1)

其中:

Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 Z^4 和 Z^5 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、羟基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、任选地被1或2个选自氟、氯、溴、甲基和氰基的取代基取代的4-至6-元杂环基、 $-S-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-S(O)-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-SO_2-(C_1-C_4-烷基)$,或

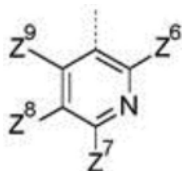
Z^1 和 Z^2 与它们所连接的碳原子一起形成5-元或6-元的杂环烷基、5-元杂芳基或6-元杂芳基,其各自可任选地被一个或两个选自下述的取代基取代:甲基、氟和氧代,和

Z^3 、 Z^4 和 Z^5 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基,或

Z^2 和 Z^3 与它们所连接的碳原子一起形成5-元或6-元的饱和的或部分饱和的杂环、5-元杂芳基或6-元杂芳基,其各自可任选地被一个或两个选自下述的取代基取代:甲基、氟和氧代,和

Z^1 、 Z^4 和 Z^5 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基,或

Q是式(Q2)的吡啶环

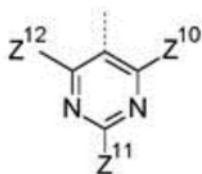


(Q2)

其中:

Z^6 、 Z^7 、 Z^8 和 Z^9 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$,或

Q是式(Q3)的嘧啶环

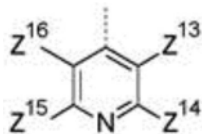


(Q3)

其中:

Z¹⁰、Z¹¹和Z¹²独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂,或

Q是式(Q4)的吡啶环

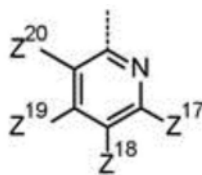


(Q4)

其中:

Z¹³、Z¹⁴、Z¹⁵和Z¹⁶独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₁-C₄-羟基烷基、NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-NH-CO-C₁-C₄-烷基和选自下述的单环杂环:4-至7-元杂环烷基或具有至少一个氮原子的5-元杂芳基,所述杂芳基环通过该氮原子与所述吡啶环相连,其各自任选地被1、2或3个独立地选自下述的取代基取代:卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(0)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-(C₁-C₄-卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-S(0)-(C₁-C₄-卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-SO₂-(C₁-C₄-卤代烷基),或

Q是式(Q5)的吡啶环

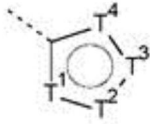


(Q5)

其中:

Z¹⁷、Z¹⁸、Z¹⁹和Z²⁰独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂,或

Q是式(Q6)的5-元芳族杂环



(Q6)

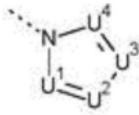
其中：

T^1-T^4 独立地选自N、O、S、C- Z^{21} 和N- Z^{22} ，其中 T^1-T^4 中不超过一个是O、 T^1-T^4 中不超过一个是S、 T^1-T^4 中不超过一个是N- Z^{22} ，并且其中

每个 Z^{21} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基，和

每个 Z^{22} 独立地选自氢、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷基- C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基，或

Q是式(Q7)的5-元芳族杂环



(Q7)

其中：

U^1-U^4 独立地选自N和C- Z^{23} ，其中 U^1-U^4 中不超过三个是N，并且其中

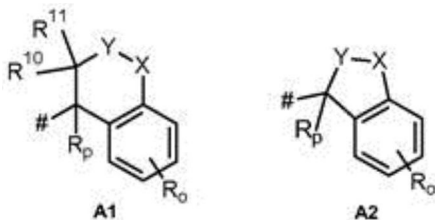
每个 Z^{23} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基，

其中当Y是O、S或N- R^9 时， R^{10} 不是-OH，

或其立体异构体、互变异构体或盐，或者它们的混合物。

4. 根据权利要求1或2所述的化合物，其中：

A是A1或A2，



o是0、1或2，

R选自卤素、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，

R_p 选自氢、 C_1-C_4 -烷基，

X选自 CR^7R^8 、O、S和N- R^9 ，

Y是 CR^7R^8 或O，

R^1 是氢或 C_1-C_4 -烷基，

R^2 选自

氢、卤素、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基) $_2$ ；

-NR 12 R 13 ；

-OR¹⁴;

-SR¹⁵、-S(O)R¹⁵、-SO₂R¹⁵;

C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₂-C₄-烯基或C₃-C₆-环烯基,其各自任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-和-C(O)-NH₂C₁-C₄-烷氧基、-NH₂、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-N(C₁-C₄-烷基)(C(O)-C₁-C₄-烷基);和

选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、杂螺环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氧代、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基-C(O)-、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、羟基-C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基-、-NH₂、-N(C₁-C₄-烷基)₂和4-至10-元杂环烷基,

R³是氢或C₁-C₄-烷基,

R⁴选自氢、卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基,

R⁵选自氢、卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基,

R⁶选自氢、卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基,

R⁷选自氢和C₁-C₄-烷基,

R⁸选自氢和C₁-C₄-烷基,

或者R⁷和R⁸一起形成氧代基团(=O),

R⁹是C₁-C₄-烷基,

R¹⁰选自氢、-OH和C₁-C₄-烷基,

R¹¹是氢,

R¹²和R¹³独立地选自

氢、-NH(-C(O)-C₁-C₄-烷基)、C₁-C₄-烷氧基;

C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、苯基-C₁-C₄-烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、-NH-C(O)-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基和(C₁-C₄-烷氧基)₂P(=O)-;

杂环基-C₁-C₄-烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、-OH、氧代、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基和C₁-C₄-烷氧基;

苯基和苯并-C₅-C₆-环烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基;和

选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氧代、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基,

R^{14} 选自

C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基和 C_3-C_6 -环烷基;和

4-至10-元杂环烷基,

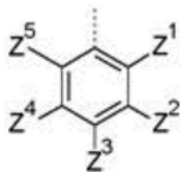
R^{15} 选自

氢;

C_1-C_4 -烷基,其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:-OH和-COOH;和

6-元杂芳基,

Q是式(Q1)的取代的苯基环



(Q1)

其中:

Z^1 和 Z^5 独立地选自氢、卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基,

Z^2 和 Z^4 独立地选自氢、卤素、氰基、-OH、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、-S-(C_1-C_4 -烷基)和4-至6-元杂环烷基,和

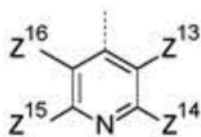
Z^3 选自氢、卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基和-N(C_1-C_4 -烷基)₂,或

Z^1 和 Z^2 与它们所连接的碳原子一起形成5-元杂环烷基或5-元杂芳基,其各自可任选地被一个或两个选自甲基、氟和氧代的取代基取代,

Z^3 和 Z^5 是氢,和

Z^4 选自氢和 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-,或

Q是式(Q4)的吡啶环



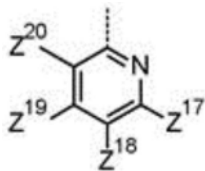
(Q4)

其中:

Z^{13} 、 Z^{14} 、 Z^{15} 和 Z^{16} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -羟基烷基、NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-NH-CO- C_1-C_4 -烷基和选自下述的单环杂环:4-至7-元杂环烷基或具有至少一个氮原子的5-元杂芳基,所述杂芳基环通过该氮原子与所述吡啶环相连,其各自任选地被1、2或3个独立地选自下述的取代基取代:卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个

卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-(C_1-C_4-卤代烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-(C_1-C_4-卤代烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-(C_1-C_4-卤代烷基)$ ，或

Q是式(Q5)的吡啶环



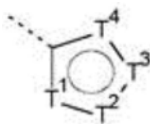
(Q5)

其中：

Z^{17} 、 Z^{18} 和 Z^{19} 是氢，和

Z^{20} 是卤素，或

Q是式(Q6)的5-元芳族杂环



(Q6)

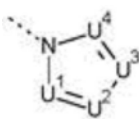
其中：

T^1-T^4 独立地选自N、O、S、C- Z^{21} 和N- Z^{22} ，其中 T^1-T^4 中不超过一个是O、 T^1-T^4 中不超过一个是S、 T^1-T^4 中不超过一个是N- Z^{22} ，并且其中

每个 Z^{21} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基，和

每个 Z^{22} 独立地选自氢、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷基- C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基，或

Q是式(Q7)的5-元芳族杂环



(Q7)

其中：

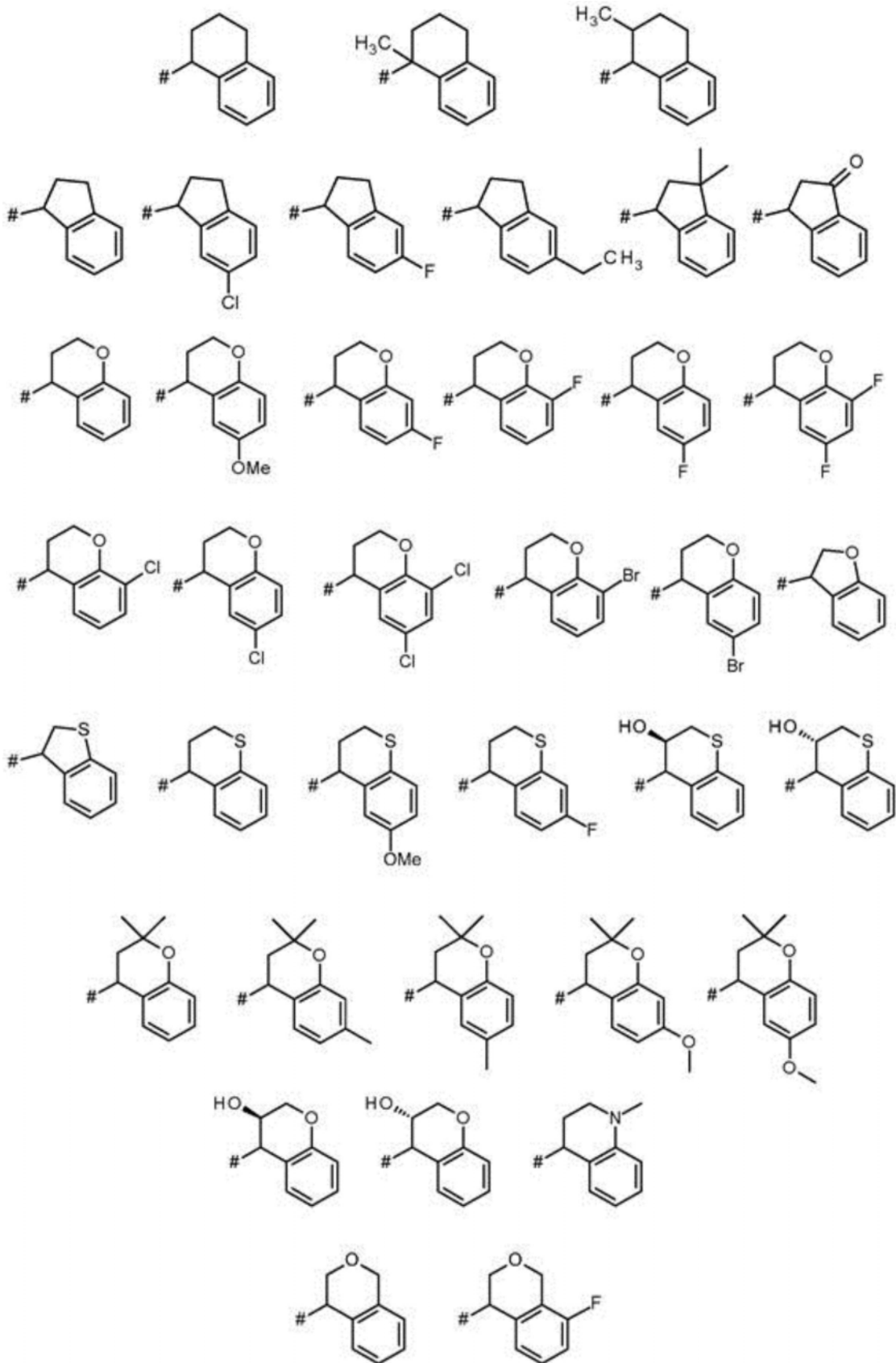
U^1-U^4 独立地选自N和C- Z^{23} ，其中 U^1-U^4 中不超过三个是N，并且其中

每个 Z^{23} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基，

或其立体异构体、互变异构体或盐，或者它们的混合物。

5. 根据权利要求1或2所述的化合物，其中：

A选自



R¹是氢或甲基,
R²选自

氢、氯、碘、 $-C(O)-N(CH_3)_2$,
 $-NR^{12}R^{13}$;
 $-OR^{14}$;
 $-SR^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-SO_2R^{15}$;

甲基、乙基、丙基、异丙基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、乙烯基、丙烯基、环戊烯基、环己烯基,其各自任选地被1或2个独立地选自下述的取代基取代: $-OH$ 、氰基、乙氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、甲氧基、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $N(CH_3)C(O)CH_3$;和

选自以下的单环或双环杂环:氮杂环丁烷、氧杂环丁烷、吡咯烷、四氢呋喃、吡啶烷、咪唑烷、1,2,4-三唑烷、哌啶、哌嗪、四氢吡喃、四氢吡啶、二氢-2H-吡喃、1,2-噁唑烷、1,2-噁嗪、吗啉、硫代吗啉、3,4-二氢异喹啉、2,3-二氢-吡啶、1,3-二氢-异吡啶、3,9-二氧杂-7-氮杂双环[3.3.1]壬烷、6-氧杂-3-氮杂双环[3.1.1]庚烷、8-氧杂-3-氮杂双环[3.2.1]辛烷、噻吩、咪唑、吡唑、1,2,4-三唑、1,2,3-三唑、1,2,3,4-四唑、吡啶、二氢吡啶、嘧啶、四氢嘧啶、4-氧杂-7-氮杂螺[2.5]辛烷,其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代:氟、氯、氰基、 $-OH$ 、氧代、 $-COOH$ 、甲氧基- $C(O)-$ 、乙氧基- $C(O)-$ 、叔丁氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、甲基、甲基- $C(O)-$ 、二氟甲基、三氟甲基、羟基甲基-、甲氧基甲基-、 $-NH_2$ 、 $-NMe_2$ 、吡咯烷,

R^3 是氢或甲基,

R^4 选自氢、氟、氯、 $-OH$ 、氰基、甲基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基和 NH_2 ,

R^5 选自氢、氟、氯、 $-OH$ 、氰基、甲基、甲氧基和三氟甲基,

R^6 选自氢、氟、氯、 $-OH$ 、氰基、甲基和甲氧基,

R^{12} 和 R^{13} 独立地选自

氢、 $-NH(-C(O)-$ 甲基)、甲氧基;

甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、环丙基、环丁基、苄基、1-苯基乙基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:氟、 $-OH$ 、 $-COOH$ 、甲氧基- $C(O)-$ 、乙氧基- $C(O)-$ 、叔丁氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NMe_2$ 、 $-NH-C(O)-$ 甲基、甲基、甲氧基、环丙基、 $-NH_2$ 、 NMe_2 、S-甲基、S(O)-甲基、 SO_2 -甲基和 $(EtO)_2P(=O)-$;

杂环基-甲基、杂环基-乙基,其中所述杂环基取代基选自氧杂环丁烷、四氢呋喃、四氢吡喃吡咯烷、吗啉、吡唑、咪唑、1,2,4-噁二唑、吡啶,其各自任选地被1个独立地选自以下的取代基取代:氟、氯、 $-OH$ 、氧代和甲基;

苯基;

2,3-二氢-1H-茛,和

选自以下的单环或双环杂环:氧杂环丁烷、硫杂环丁烷、吡咯烷、吗啉、四氢吡喃、吡啶和吡唑,其各自任选地被1或2个独立地选自下述的取代基取代:氟、氯、 $-OH$ 、氧代、甲基;

R^{14} 选自

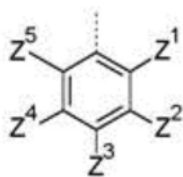
甲基、乙基、异丙基、丁基、环戊基、苄基,其各自任选地被1或2个独立地选自下述的取代基取代:氟、 $-OH$ 、甲基、甲氧基和环戊基;和

选自以下的单环或双环杂环:吡咯烷和四氢吡喃,

R^{15} 选自

甲基和乙基,其各自任选地被1个独立地选自以下的取代基取代: $-OH$ 和 $-COOH$;和吡啶,

Q是式 (Q1) 的取代的苯基环



(Q1)

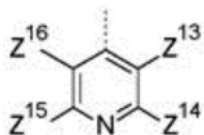
其中:

Z^1 和 Z^5 独立地选自氢、氟、氯、甲基、三氟甲基和甲氧基,

Z^2 和 Z^4 独立地选自氢、氟、氯、-OH、氰基、甲基、乙基、叔丁基、-NHMe、-NMe₂、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、-SMe和吗啉基,和

Z^3 独立地选自氢、氟、氯、甲基、甲氧基、二氟甲氧基和-NMe₂,或

Q是式 (Q4) 的吡啶环

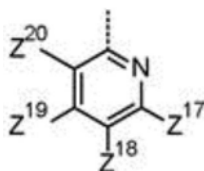


(Q4)

其中:

Z^{13} 、 Z^{14} 、 Z^{15} 和 Z^{16} 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、甲氧基、乙氧基、异丙氧基、羟基甲基、NH₂、-NHMe-NMe₂、-NH-C(O)-Me、吗啉基,或

Q是式 (Q5) 的吡啶环



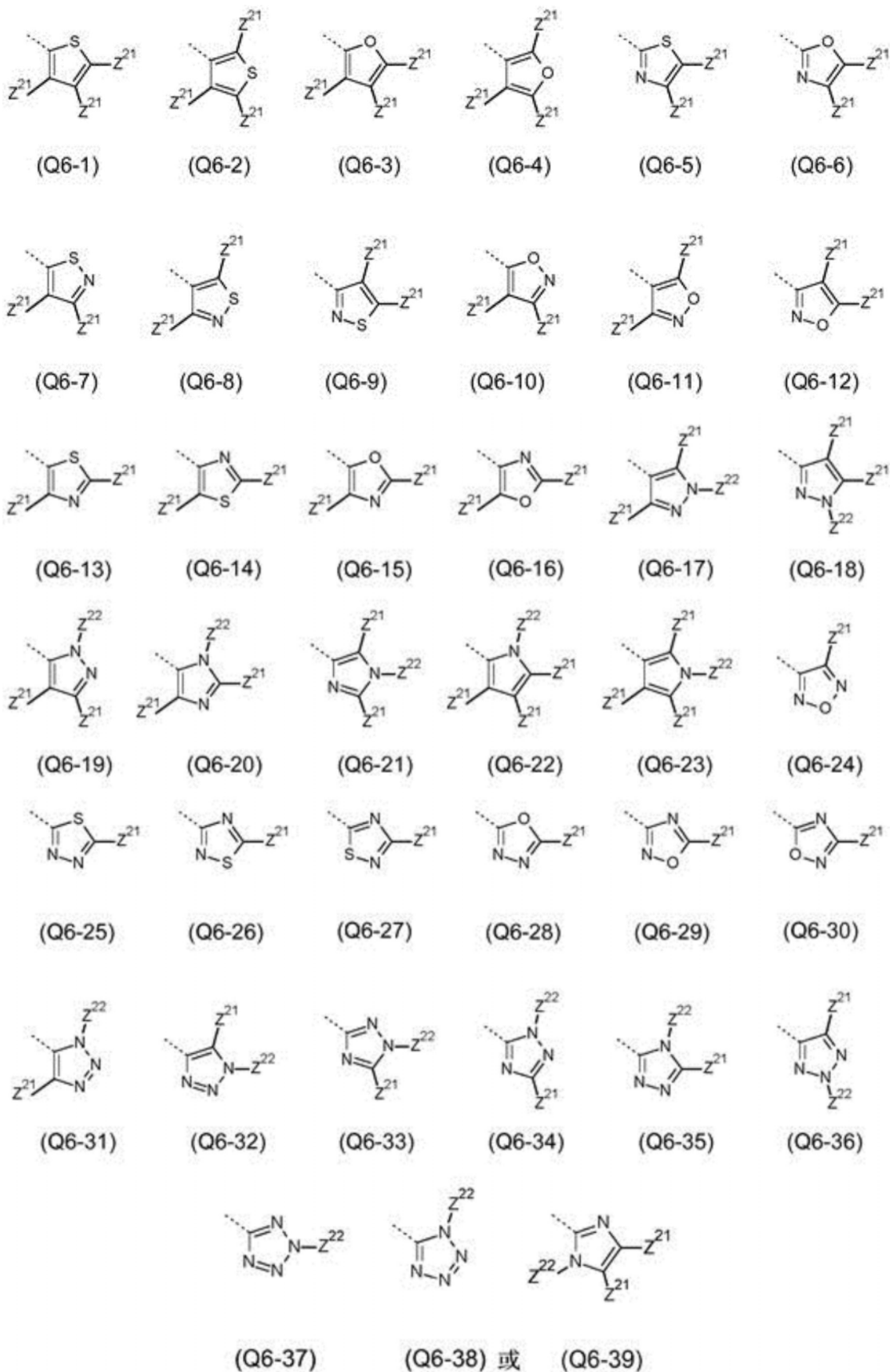
(Q5)

其中:

Z^{17} 、 Z^{18} 和 Z^{19} 是氢,和

Z^{20} 是氟、氯,或

Q选自

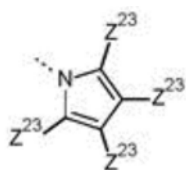


其中：

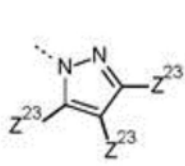
每个Z²¹独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基和

Z^{22} 是氢、甲基,或

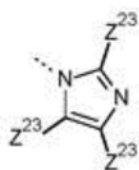
Q选自



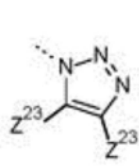
(Q7-1)



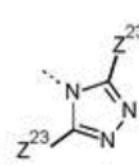
(Q7-2)



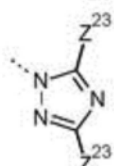
(Q7-3)



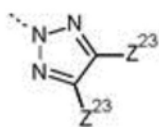
(Q7-4)



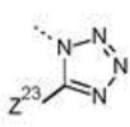
(Q7-5)



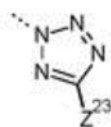
(Q7-6)



(Q7-7)



(Q7-8)

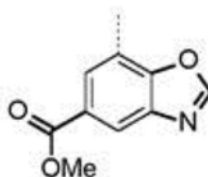
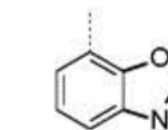
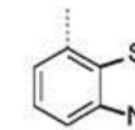
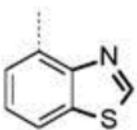
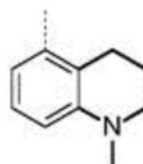
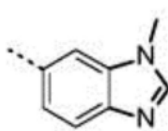
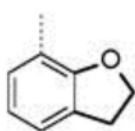
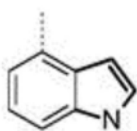


(Q7-9)

其中:

每个 Z^{23} 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基,或

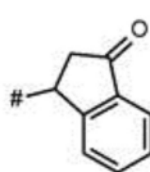
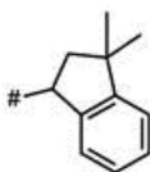
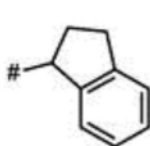
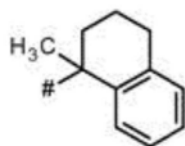
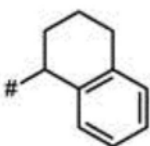
Q选自

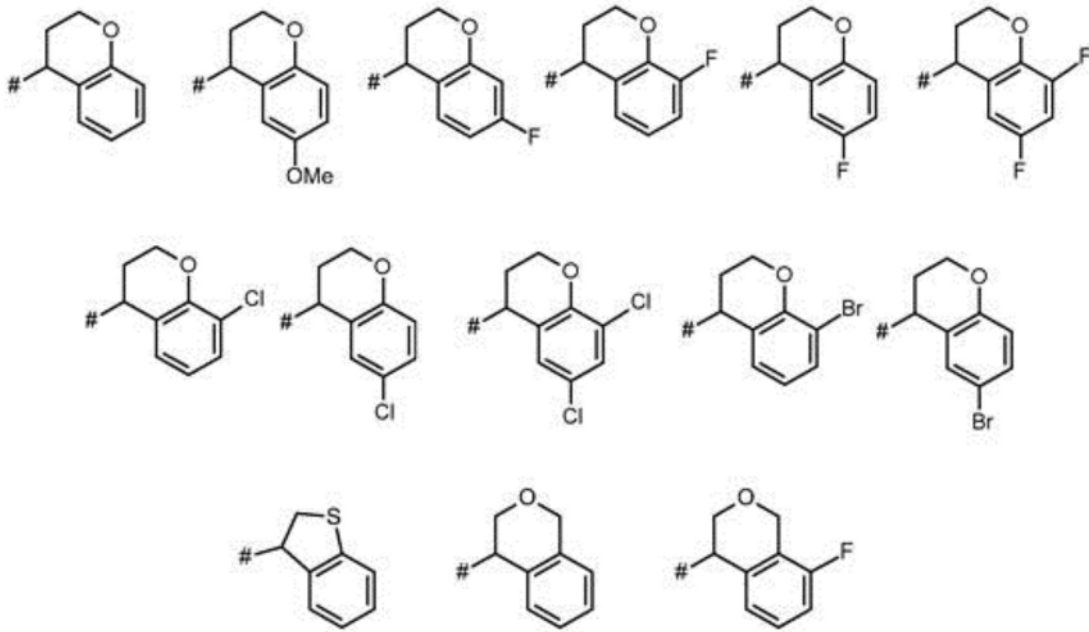


或其立体异构体、互变异构体或盐,或者它们的混合物。

6. 根据权利要求1或2所述的化合物,其中:

A选自





R¹是氢或甲基,

R²选自

氯、碘、-C(O)-N(CH₃)₂,

-NR¹²R¹³;

-OR¹⁴;

-SR¹⁵、-S(O)R¹⁵、-SO₂R¹⁵;

甲基、乙基、丙基、异丙基、环丙基、环丁基、环戊基、乙烯基、丙烯基,其各自任选地被1或2个独立地选自下述的取代基取代:-OH、氰基、乙氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、甲氧基、NH₂、N(CH₃)₂、N(CH₃)(C(O)CH₃);和

选自以下的单环或双环杂环:氮杂环丁烷、氧杂环丁烷、吡咯烷、四氢呋喃、吡啶烷、咪唑烷、1,2,4-三唑烷、哌啶、哌嗪、四氢吡喃、二氢-2H-吡喃、1,2-噁唑烷、吗啉、硫代吗啉、3,4-二氢异喹啉、2,3-二氢-吡啶、1,3-二氢-异吡啶、3,9-二氧杂-7-氮杂双环[3.3.1]壬烷、6-氧杂-3-氮杂双环[3.1.1]庚烷、8-氧杂-3-氮杂双环[3.2.1]辛烷、噻吩、咪唑、吡啶、1,2,3-三唑、1,2,3,4-四唑、吡啶、二氢吡啶、嘧啶、四氢嘧啶,其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代:氟、-OH、氧代、-COOH、甲氧基-C(O)-、乙氧基-C(O)-、叔丁氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、甲基、甲基-C(O)-、二氟甲基、三氟甲基、羟基甲基-、甲氧基甲基-、-NH₂、-NMe₂、吡咯烷,

R³是氢或甲基,

R⁴选自氢、氯、氟、甲基、甲氧基和三氟甲基,

R⁵选自氢、氯、氟、-OH、氰基、甲基、三氟甲氧基和NH₂,

R⁶选自氢、氟、氯、-OH、氰基、甲基和甲氧基,

R¹²和R¹³独立地选自

氢、-NH(-C(O)-甲基)、甲氧基;

甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、环丙基、环丁基、苄基、1-苯基乙基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:氟、-OH、-COOH、甲氧基-C(O)-、乙氧基-C

(O) -、叔丁氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NMe₂、-NH-C(O)-甲基、甲基、甲氧基、环丙基、-NH₂、-NMe₂、SO₂-甲基和 (EtO)₂P(=O)-;

杂环基-甲基、杂环基-乙基,其中所述杂环基取代基选自氧杂环丁烷、四氢呋喃、四氢吡喃、吡咯烷、吡啶、咪唑、1,2,4-噁二唑、吗啉、吡啶,其各自任选地被1个独立地选自以下的取代基取代:氧代和甲基;

苯基;

2,3-二氢-1H-茚,和

选自以下的单环或双环杂环:氧杂环丁烷、吗啉、四氢吡喃、吡啶和吡啶;

R¹⁴选自

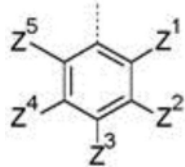
甲基、乙基、异丙基、丁基、环戊基、苄基,其各自任选地被1或2个独立地选自以下的取代基取代:氟、-OH、甲基、甲氧基和环戊基;和

选自以下的单环或双环杂环:吡咯烷和四氢吡喃,

R¹⁵选自

甲基和乙基,其各自任选地被1个独立地选自以下的取代基取代:-OH和-COOH;和吡啶,

Q是式(Q1)的取代的苯基环



(Q1)

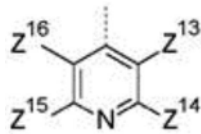
其中:

Z¹和Z⁵独立地选自氢、氟、氯、甲基、甲氧基和三氟甲基,

Z²和Z⁴独立地选自氢、氟、氯、-OH、氰基、甲基、乙基、叔丁基、-NHMe、-NMe₂、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、-SMe和吗啉基,和

Z³独立地选自氢、氟、氯、甲基、甲氧基、二氟甲氧基和-NMe₂,或

Q是式(Q4)的吡啶环



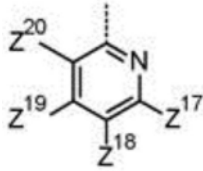
(Q4)

其中:

Z¹⁴和Z¹⁵独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、甲氧基、乙氧基、异丙氧基、羟基甲基、NH₂、吗啉基和

Z¹³和Z¹⁶独立地选自氢、氟、氯、甲基、甲氧基,或

Q是式(Q5)的吡啶环



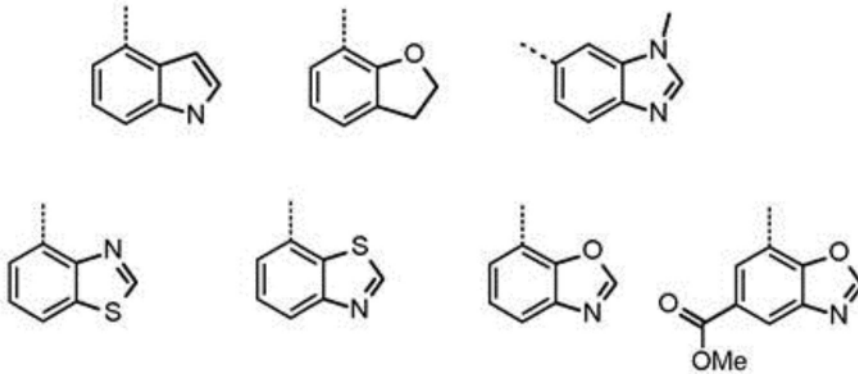
(Q5)

其中:

Z¹⁷、Z¹⁸和Z¹⁹是氢,和

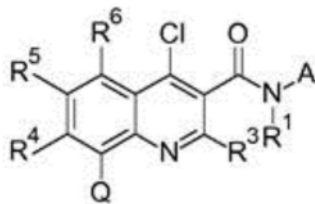
Z²⁰是氟,或

Q选自



或其立体异构体、互变异构体或盐,或者它们的混合物。

7. 制备根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物的方法,所述方法包括下述步骤:使通式1N的中间体化合物



1N,

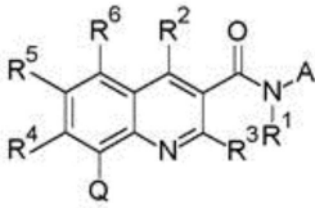
其中A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶和Q如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义,与通式1F的化合物反应:

R²H

1F,

其中R²是NR¹²R¹³、OR¹⁴或SR¹⁵,各自如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义,

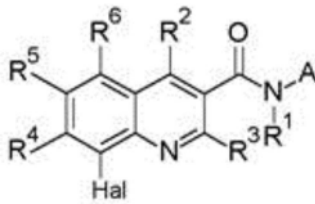
由此提供通式(I)的化合物:



(I),

其中A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和Q如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义,

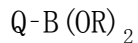
或者下述步骤:使通式1T的中间体化合物



1T,

其中A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵和R⁶如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义,和其中Hal是卤素,

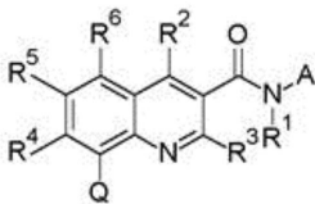
与通式1H的化合物反应:



1H,

其中Q如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义,和每个R可以独立地为H或Me,或者两个R均为频哪醇基,

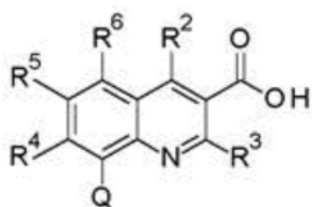
由此提供通式(I)的化合物:



(I),

其中A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和Q如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义,

或者下述步骤:使通式1W的中间体化合物



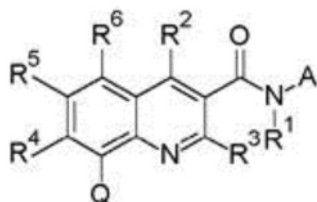
1W,

其中Q、R²、R³、R⁴、R⁵和R⁶如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义,与通式1M的化合物反应:



1M,

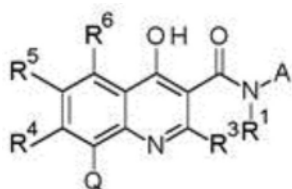
其中R¹和A如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义,由此提供通式(I)的化合物:



(I),

其中A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和Q如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义,

或者下述步骤:使通式1X的中间体化合物



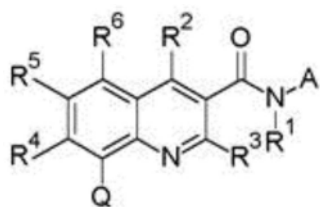
1X,

其中Q、A、R¹、R³、R⁴、R⁵和R⁶如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义,与通式1Y的化合物反应:



1Y,

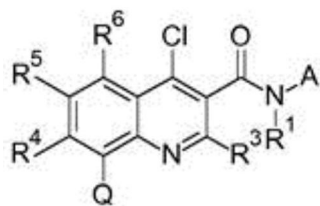
其中R²是OR¹⁴,其如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义,由此提供通式(I)的化合物:



(I),

其中A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶和Q如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义，和R²是任选取代的C¹-C⁴-烷氧基，其如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义，

或者下述步骤：使通式1N的中间体化合物



1N,

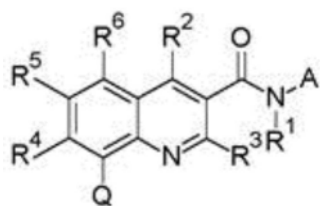
其中Q、A、R¹、R³、R⁴、R⁵和R⁶如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义，与通式2A的化合物反应：



2A,

其中R²是C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₂-C₄-烯基、C₃-C₆-环烯基、C₂-C₄-炔基或苯基-C₁-C₄-烷基，其各自如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义是任选取代的，Met是镁或锌，和X是氯、溴或碘，

由此提供通式(I)的化合物：

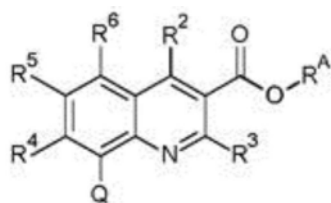


(I),

其中A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶和Q如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义，和R²是C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₂-C₄-烯基、C₃-C₆-环烯基、C₂-C₄-炔基或苯基-C₁-C₄-烷基，其各自如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义是任选取代的。

8. 根据权利要求7所述的制备方法，其中通式1T的中间体化合物的卤素是氯、溴或碘。

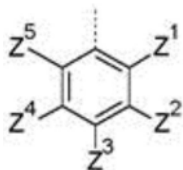
9. 通式(II)的中间体化合物：



(II),

其中:

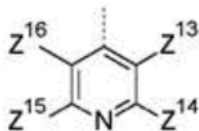
R^2 是-OH或如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义,
 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 如根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物所定义,
 Q是式(Q1)的取代的苯基环



(Q1)

其中:

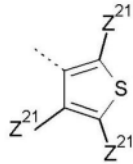
Z^1 和 Z^5 独立地选自氢、氟、氯、甲基和三氟甲基,
 Z^2 和 Z^4 独立地选自氢、氟、氯、-OH、氰基、甲基、乙基、叔丁基、-NHMe、-NMe₂、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、-SMe和吗啉基,和
 Z^3 独立地选自氢、氟、氯、甲基、甲氧基、二氟甲氧基和-NMe₂,或
 Q是式(Q4)的吡啶环



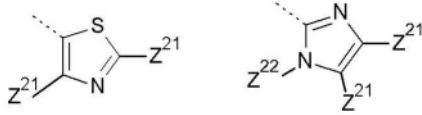
(Q4)

其中:

Z^{13} 、 Z^{14} 、 Z^{15} 和 Z^{16} 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、甲氧基、乙氧基、异丙氧基、羟基甲基、NH₂、NHMe-NMe₂、-NH-C(O)-Me、吗啉基或
 Q选自



(Q6-2)

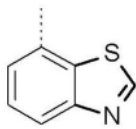


(Q6-13) 或 (Q6-39)

其中:

每个 Z^{21} 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基和
 Z^{22} 是氢、甲基,或

Q选自

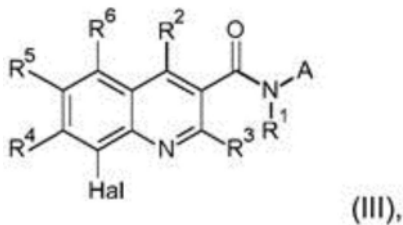


和

R^A 是H或 C_1-C_4 -烷基,

或其立体异构体、互变异构体或盐,或者它们的混合物。

10. 通式 (III) 的化合物:



(III),

其中:

R^2 是-OH或如根据权利要求1至6中任一项所述的通式 (I) 化合物所定义,

A、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 如根据权利要求1至6中任一项所述的通式 (I) 化合物所定义,和

Hal是卤素,

或其立体异构体、互变异构体或盐,或者它们的混合物。

11. 药物组合物,其包含根据权利要求1至6中任一项所述的通式 (I) 化合物和一种或多种药学上可接受的赋形剂。

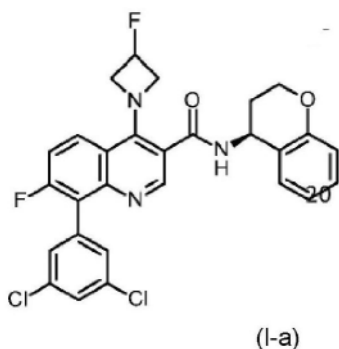
12. 根据权利要求1至6中任一项所述的通式 (I) 化合物在制备用于控制、治疗和/或预防疾病的药物中的用途。

13. 根据权利要求12所述的用途,其中所述疾病是蠕虫感染。

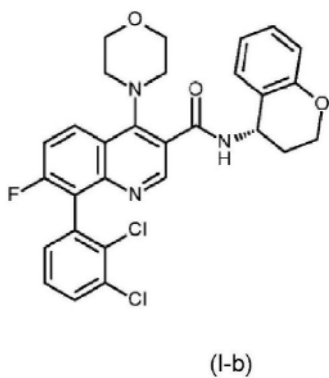
14. 根据权利要求1至6中任一项所述的通式 (I) 化合物在制备用于在人和/或动物中控制

制蠕虫感染的药物中的用途。

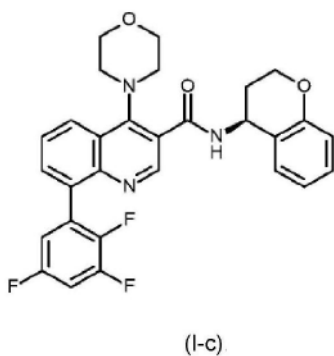
15. 根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物,其中所述化合物为式(I-a)的化合物



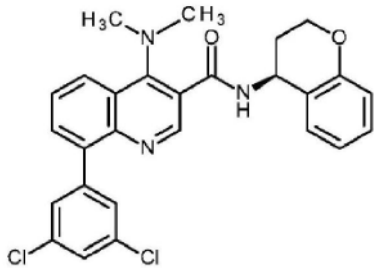
16. 根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物,其中所述化合物为式(I-b)的化合物



17. 根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物,其中所述化合物为式(I-c)的化合物



18. 根据权利要求1至6中任一项所述的通式(I)化合物,其中所述化合物为式(I-d)的化合物



(I-d)

新的抗蠕虫药喹啉-3-甲酰胺衍生物

[0001] 本发明涉及如本文中所述和定义的新的通式(I)的喹啉衍生物;制备所述化合物的方法;用于制备所述化合物的中间体化合物;包含所述化合物的药物组合物和组合(combination);以及所述化合物用于制备药物组合物中的用途,所述药物组合物用于控制、治疗和/或预防疾病,特别是用于控制、治疗和/或预防动物和人中的蠕虫感染,更特别是胃肠和肠外线虫感染;涉及含有这些化合物的制剂以及作为唯一的药剂或与其它活性成分组合用于控制、治疗和/或预防动物和人中的蠕虫感染,更特别是胃肠和肠外线虫感染的方法。

背景技术

[0002] 对所有商用抗蠕虫药的抗药性的出现似乎是兽药学领域中日益严重的问题。广泛使用抗蠕虫药来进行对线虫的控制导致高抗性蠕虫种群的显著选择。因此,对所有抗蠕虫的药物类别的抗药性的蔓延威胁到在牛、山羊、绵羊和马中的有效蠕虫控制。此外,目前仅依赖于使用大环内酯类的对犬的心丝虫病成功预防处于危险之中,因为在美国的一些地区对多种大环内酯类的功效丧失已经有所描述 - 特别是在那些心丝虫感染的挑战很高的地区。最后,对来自密西西比河下游三角洲的被怀疑丧失功效的牧场的病例的犬心丝虫(*Dirofilaria immitis*)幼虫的实验性感染研究为大环内酯抗性的存在提供了体内确证。

[0003] 尽管人蠕虫对抗蠕虫药的抗性似乎目前很少见,但如前所述,对抗蠕虫药的抗性在兽药领域中的蔓延也需要在人蠕虫病的治疗中加以考虑。对丝虫病持续的剂量不足的治疗可能导致高度抗性的基因型,并且对某些抗蠕虫药(例如吡喹酮、苯并咪唑和氯硝柳胺)已经对其抗性有所描述。

[0004] 因此,迫切需要具有新的分子作用机制的破坏抗性的抗蠕虫药。

[0005] 本发明的目的是提供可用作医药领域、尤其是兽药领域的抗蠕虫药的化合物,其具有令人满意或改善的抗广谱蠕虫的抗蠕虫活性,特别是在相对低的剂量下,用于控制、治疗和/或预防动物和人中的蠕虫感染,优选对被治疗的生物体没有任何不利的毒性作用。

[0006] JP2008-214323A中描述了某些喹啉甲酰胺类作为适用于治疗和/或预防皮肤病(如寻常痤疮,皮炎等)的药剂。

[0007] W02017103851公开了作为H-PGDS抑制剂的喹啉-3-甲酰胺类,用于治疗动脉粥样硬化、银屑病、鼻窦炎和杜氏肌营养不良症(duchenne muscular dystrophy)。

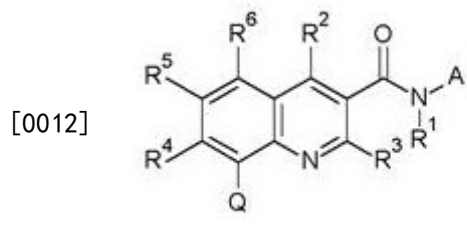
[0008] 然而,现有技术没有描述如本文所述和定义的本发明的通式(I)的新的喹啉衍生物。

[0009] 现已发现,本发明的化合物具有令人惊讶和有利的性质,这构成了本发明的基础。

[0010] 特别地,已经令人惊讶地发现本发明的化合物与线虫的Slc10-1钙门控钾通道有效地相互作用。这种相互作用的特征在于实现特别是胃肠线虫、自由生活线虫和细长丝状线虫(filariae)的麻痹/抑制,其数据在生物实验部分中给出。因此,本发明的化合物可用作抗蠕虫药,用于控制、治疗和/或预防胃肠和肠外蠕虫感染,特别是包括细长丝状线虫在内的线虫的胃肠和肠外感染。

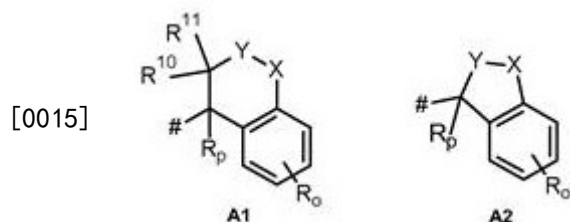
发明内容

[0011] 根据第一方面,本发明涉及通式(I)的化合物及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物:



[0013] 其中:

[0014] A是A1或A2,



[0016] o是0、1、2、3或4,

[0017] R选自氢、卤素、氰基、硝基、-OH、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基,

[0018] R_p选自氢、C₁-C₄-烷基,

[0019] X、Y 独立地选自CR⁷R⁸、O、S、和N-R⁹,其中X和Y中的至少一个是CR⁷R⁸,或

[0020] X、Y 一起形成选自以下的环成员:-C(O)-O-、-C(O)-NR⁹-、-S(O)-NR⁹-、-SO₂-NR⁹-和-SO₂-O-,

[0021] R¹选自氢、氰基、-CHO、-OH、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、具有1至5个卤素原子的C₃-C₆-卤代环烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₃-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、-NH-C₁-C₄-烷基、-N(C₁-C₄-烷基)₂、NH₂-C₁-C₄-烷基、-C₁-C₄-烷基-NH-C₁-C₄-烷基、-(C₁-C₄-烷基)₂N-C₁-C₄-烷基、-C₁-C₄-烷基-C(O)-、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基-C(O)-、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、苄氧基-C(O)-、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基-C(O)-、-SO₂-C₁-C₄-烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基;

[0022] 苯基-C₁-C₄-烷基,任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、-NO₂、氰基、具有1至5个卤素原子C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基;

[0023] 杂环基-C₁-C₄-烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基

和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、-NO₂、氰基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基,

[0024] R²选自

[0025] 氢、卤素、氰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂;

[0026] -NR¹²R¹³;

[0027] -OR¹⁴;

[0028] -SR¹⁵、-S(O)R¹⁵、-SO₂R¹⁵;

[0029] C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₂-C₄-烯基、C₃-C₆-环烯基、C₂-C₄-炔基或苯基-C₁-C₄-烷基,其各自任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、-NO₂、氰基、C₁-C₄-烷基-C(O)-、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-NH(C(O)-C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)(C(O)-C₁-C₄-烷基)、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基;

[0030] 杂环基-C₁-C₄-烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、-NO₂、氰基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基;

[0031] 苯基,其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、硝基、-OH、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基;和

[0032] 选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、杂螺环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基-C(O)-、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、羟基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基和4-至10-元杂环烷基,

- [0033] R^3 是氢或 C_1-C_4 -烷基，
- [0034] R^4 选自氢、卤素、-OH、氰基、 C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷基-C(O)-、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基，
- [0035] R^5 选自氢、卤素、-OH、氰基、 C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷基-C(O)-、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基，
- [0036] R^6 选自氢、卤素、-OH、氰基、 C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_1-C_4 -烷基-C(O)-、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基，
- [0037] R^7 选自氢、-OH、氟、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，
- [0038] R^8 选自氢、-OH、氟、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，
- [0039] 或者 R^7 和 R^8 一起形成氧代基团(=O)，
- [0040] 或者 R^7 和 R^8 与它们所连接的碳原子一起形成选自以下的3-至6-元环： C_3-C_6 -环烷基和3-至6-元杂环烷基，
- [0041] R^9 选自氢、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，
- [0042] R^{10} 选自氢、-OH、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，
- [0043] R^{11} 选自氢、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，
- [0044] 或者 R^{10} 和 R^{11} 与它们所连接的碳原子一起形成选自以下的3-至6-元环： C_3-C_6 -环烷基和3-至6-元杂环烷基，
- [0045] R^{12} 和 R^{13} 独立地选自
- [0046] 氢、-OH、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-NH-C(O)- C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)-C(O)- C_1-C_4 -烷基)、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-；
- [0047] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、-OH、氰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C_1-C_4 -烷基)、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-NH-C(O)- C_1-C_4 -烷基、-N(C_1-C_4 -烷基)-C(O)- C_1-C_4 -烷基)、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基和(C_1-C_4 -烷氧基)₂P(=O)-；
- [0048] 杂环基- C_1-C_4 -烷基，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C_1-C_4 -烷基)、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羧基- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -

烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；

[0049] 苯基、苯并-C₅-C₆-环烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；

[0050] 选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、羟基-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；

[0051] R¹⁴选自

[0052] -NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂；

[0053] C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、苯基-C₁-C₄-烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、-OH、氰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；

[0054] 杂环基-C₁-C₄-烷基，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、羟基-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；

[0055] 苯基，其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、-OH、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基；和

[0056] 选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羟基- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基,

[0057] R¹⁵ 选自

[0058] 氢;

[0059] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基;

[0060] 杂环基- C_1-C_4 -烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羟基- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基;

[0061] 苯基,其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、硝基、-OH、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基;和

[0062] 选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羟基- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基,

[0063] Q选自6-或10-元芳基和5-至10-元杂芳基,其各自任选地被1、2、3、4或5个选自以

下的取代基取代:卤素、 SF_5 、氰基、 $-\text{CHO}$ 、硝基、氧代、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -羟基烷基、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷基、羟基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ -环烷基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基、氰基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -卤代烷氧基、 $-\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{NH-SO}_2\text{-}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{N}(\text{SO}_2\text{-}[\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}])(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷氧基亚氨基})\text{-C}_1\text{-C}_4\text{-烷基}$ 、任选地被1或2个选自氟、氯、溴、甲基和氰基的取代基取代的4-至6-元杂环基、 $-\text{CH}_2\text{-O-}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{CH}_2\text{-NH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{CH}_2\text{-N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})_2$ 、被4-至6-元杂环基取代的甲基,所述4-至6-元杂环基本身任选地被1或2个选自氟、氯、溴、甲基和氰基的取代基取代、 $-\text{CH}_2\text{-S-}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{CH}_2\text{-S(O)-}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{CH}_2\text{-SO}_2\text{-}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{S-}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{S(O)-}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{SO}_2\text{-}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、具有1至5个卤素原子的 $-\text{S-}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基})$ 、具有1至5个卤素原子的 $-\text{S(O)-}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基})$ 、具有1至5个卤素原子的 $-\text{SO}_2\text{-}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基})$ 、 $-\text{CONH}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{CONH}(\text{C}_3\text{-C}_6\text{-环烷基})$ 、 $-\text{NHC(O)}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 、 $-\text{NHC(O)}(\text{C}_3\text{-C}_6\text{-环烷基})$ 、具有1至5个卤素原子的 $-\text{NHC(O)}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-卤代烷基})$,

[0064] 其中当Y是O、S或 N-R^9 时, R^7 、 R^8 、 R^{10} 和 R^{11} 都不是OH,并且其中当X是O、S或 N-R^9 时, R^7 和 R^8 都不是OH。

[0065] 定义

[0066] 术语“取代”指指定原子或基团上的一个或多个氢原子被来自所示基团的选择替代,前提在于,在现有情况下不超过指定原子的正常价态。取代基和/或变量的组合是允许的。

[0067] 术语“任选取代的”指取代基的数量可以等于或者不同于零。除非另有说明,任选取代的基团通过在任意可供的碳或氮原子上用非氢取代基替代氢原子来被与可容纳的量一样多的任选取代基取代是可能的。通常,任选取代基的数量在存在时可能为1、2、3、4或5,特别是1、2或3。

[0068] 如本文中使用的,例如在本发明的通式(I)的化合物的取代基定义中的术语“一个或多个”指“1、2、3、4或5个,特别是1、2、3或4个,更特别是1、2或3个,还更特别是1或2个”。

[0069] 如本文中使用的,氧代取代基表示经由双键而键合于碳原子或硫原子的氧原子。

[0070] 术语“环取代基”指连接于芳族或非芳族环且替代了环上的可用氢原子的取代基。

[0071] 假如复合取代基由多于一个部分组成,例如 $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷氧基})\text{-}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})\text{-}$,则该给定部分的位置可能在所述复合取代基的任意适合位置,即所述 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基部分可以连接于所述 $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷氧基})\text{-}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})\text{-}$ 基团的 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基部分的任意碳原子。这样的复合取代基的开头或结尾的连字符表示所述复合取代基与分子剩余部分的连接点。假如包含碳原子和任选的一个或多个诸如氮、氧或硫原子的杂原子的环例如被取代基取代,则所述取代基可能键合于所述环的任意适合位置,只要其键合于适合的碳原子和/或适合的杂原子。

[0072] 如本文所用,各个取代基与分子的其余部分连接的位置可以在画出的结构中通过所述取代基中的散列符号(#)或虚线来描绘。

[0073] 在本说明书中使用时,术语“包含”包括“由……组成”。

[0074] 如果本文本内将任何项目指称为“如本文中所述”,则其指可以在本文本中的任意部位提及。

[0075] 如本文本中提及的术语具有下述含义:

[0076] 术语“卤素原子”指氟、氯、溴或碘原子,特别是氟、氯或溴原子。

[0077] 术语“ C_1-C_6 -烷基”指直链或支链的、饱和的具有1、2、3、4、5或6个碳原子的一价烃基。术语“ C_1-C_4 -烷基”指直链或支链的、饱和的具有1、2、3或4个碳原子的一价烃基，例如甲基、乙基、正丙基、异丙基、正丁基、仲丁基、异丁基或叔丁基，或者其异构体。特别地，所述基团具有1、2或3个碳原子（“ C_1-C_3 -烷基”），例如甲基、乙基、正丙基或异丙基。

[0078] 术语“ C_1-C_4 -羟基烷基”指直链或支链的、饱和的一价烃基，其中所述术语“ C_1-C_4 -烷基”如上文所定义，并且其中1个或2个氢原子被羟基替代，例如羟基甲基、1-羟基乙基、2-羟基乙基、1,2-二羟基乙基、3-羟基丙基、2-羟基丙基、1-羟基丙基、1-羟基丙-2-基、2-羟基丙-2-基、2,3-二羟基丙基、1,3-二羟基丙-2-基、3-羟基-2-甲基-丙基、2-羟基-2-甲基-丙基、1-羟基-2-甲基-丙基。

[0079] 术语“-NH(C_1-C_4 -烷基)”或“-N(C_1-C_4 -烷基)₂”指直链或支链的、饱和一价基团，其中所述术语“ C_1-C_4 -烷基”如上文所定义，例如甲基氨基、乙基氨基、正丙基氨基、异丙基氨基、*N,N*-二甲基氨基、*N*-甲基-*N*-乙基氨基或*N,N*-二乙基氨基。

[0080] 术语“-S- C_1-C_4 -烷基”、“-S(O)- C_1-C_4 -烷基”或“-SO₂- C_1-C_4 -烷基”指直链或支链的、饱和的基团，其中所述术语“ C_1-C_4 -烷基”如上文所定义，例如甲基硫烷基、乙基硫烷基、正丙基硫烷基、异丙基硫烷基、正丁基硫烷基、仲丁基硫烷基、异丁基硫烷基或叔丁基硫烷基、甲基亚磺酰基、乙基亚磺酰基、正丙基亚磺酰基、异丙基亚磺酰基、正丁基亚磺酰基、仲丁基亚磺酰基、异丁基亚磺酰基或叔丁基亚磺酰基，或者甲基磺酰基、乙基磺酰基、正丙基磺酰基、异丙基磺酰基、正丁基磺酰基、仲丁基磺酰基、异丁基磺酰基或叔丁基磺酰基。

[0081] 术语“ C_1-C_4 -卤代烷基”指直链或支链的、饱和的一价烃基，其中所述术语“ C_1-C_4 -烷基”如上文所定义，并且其中一个或多个氢原子相同或不同地被卤素原子替代。特别地，所述卤素原子是氟原子。更特别地，所有所述卤素原子是氟原子（“ C_1-C_4 -氟烷基”）。所述 C_1-C_4 -卤代烷基是，例如，氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基、3,3,3-三氟丙基或1,3-二氟丙-2-基。

[0082] 术语“ C_1-C_4 -烷氧基”指直链或支链的、饱和的式(C_1-C_4 -烷基)-O-的一价基团，其中所述术语“ C_1-C_4 -烷基”如上文所定义，例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、异丙氧基、正丁氧基、仲丁氧基、异丁氧基或叔丁氧基，或者它们的异构体。

[0083] 术语“ C_1-C_4 -卤代烷氧基”指如上文所定义的直链或支链的、饱和的一价 C_1-C_4 -烷氧基，其中一个或多个氢原子相同或不同地被卤素原子替代。特别地，所述卤素原子是氟原子。所述 C_1-C_4 -卤代烷氧基是例如，氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、2,2,2-三氟乙氧基或五氟乙氧基。

[0084] 术语“ C_2-C_4 -烯基”指直链或支链的一价烃基，其含有一个双键，且其具有2、3或4个碳原子。所述 C_2-C_4 -烯基是例如乙烯基（或“乙烯基(vinyl)”）、丙-2-烯-1-基（或“烯丙基”）、丙-1-烯-1-基、丁-3-烯基、丁-2-烯基、丁-1-烯基、丙-1-烯-2-基（或“异丙烯基”）、2-甲基丙-2-烯基、1-甲基丙-2-烯基、2-甲基丙-1-烯基或1-甲基丙-1-烯基。特别地，所述基团是烯丙基。

[0085] 术语“ C_2-C_4 -炔基”指直链的一价烃基，其含有一个三键，且其含有2、3或4个碳原子。所述 C_2-C_4 -炔基是，例如，乙炔基、丙-1-炔基、丙-2-炔基（或“炔丙基”）、丁-1-炔基、丁-2-炔基、丁-3-炔基或1-甲基丙-2-炔基。特别地，所述炔基是丙-1-炔基或丙-2-炔基。

[0086] 术语“ C_3-C_6 -环烷基”指饱和的一价单环烃环，其含有3、4、5或6个碳原子（“ C_3-C_6 -

环烷基”)。所述 C_3-C_6 -环烷基是例如,单环烃环,例如环丙基、环丁基、环戊基或环己基。

[0087] 术语“ C_3-C_6 -卤代环烷基”指饱和的一价单环烃环,其中所述术语“ C_3-C_6 -环烷基”如上文所定义,并且其中一个或多个氢原子相同或不同地被卤素原子替代。特别地,所述卤素原子是氟或氯原子。所述 C_3-C_6 -卤代环烷基是例如,被一个或两个氟或氯原子取代的单环烃环,例如1-氟-环丙基、2-氟环丙基、2,2-二氟环丙基、2,3-二氟环丙基、1-氯环丙基、2-氯环丙基、2,2-二氯环丙基、2,3-二氯环丙基、2-氟-2-氯环丙基和2-氟-3-氯环丙基。

[0088] 术语“苯并- C_5-C_6 -环烷基”指一价双环烃环,其中含有5或6个碳原子的饱和一价单环烃环(“ C_5-C_6 -环烷基”)与苯环稠合。所述苯并- C_5-C_6 -环烷基是例如,双环烃环,例如茛满(即2,3-二氢-1*H*-茛)或四氢萘(即1,2,3,4-四氢化萘)基团。

[0089] 术语“螺环烷基”指饱和的单价双环烃基,其中两个环共有-一个共同的环上碳原子,并且其中所述双环烃基含有5、6、7、8、9、10或11个碳原子,所述螺环烷基可能通过除螺碳原子之外的任何一个碳原子与分子的其余部分相连。所述螺环烷基是,例如,螺[2.2]戊基、螺[2.3]己基、螺[2.4]庚基、螺[2.5]辛基、螺[2.6]壬基、螺[3.3]庚基、螺[3.4]辛基、螺[3.5]壬基、螺[3.6]癸基、螺[4.4]壬基、螺[4.5]癸基、螺[4.6]十一烷基或螺[5.5]十一烷基。

[0090] 术语“杂环烷基”指单环或双环的、饱和或部分饱和的杂环,总共具有4、5、6、7、8、9或10个环原子(“4-至10-元杂环烷基”基团),特别是4、5或6个环原子(“4-至6-元杂环烷基”基团),其含有一个或两个相同或不同的选自系列N、O和S的环上杂原子,所述杂环烷基可能通过任何一个碳原子或者,如果存在的话,氮原子,与分子的其余部分相连。

[0091] 所述杂环烷基可以为下述但不限于此:4元环,例如氮杂环丁烷基、氧杂环丁烷基或硫杂环丁烷基,作为例子;或5元环,例如四氢呋喃基、氧杂环戊烷基、1,3-二氧杂环戊烷基、硫杂环戊烷基、吡咯烷基、咪唑烷基、吡唑烷基、1,1-二氧化硫杂环戊烷基、1,2-噁唑烷基、1,3-噁唑烷基、1,3-噻唑烷基或1,2,4-三唑烷基,作为例子;或6元环,例如四氢吡喃基、四氢噻喃基、哌啶基、吗啉基、二噻烷基、硫代吗啉基、哌嗪基、噁烷基、1,3-二噁烷基、1,4-二噁烷基或1,2-噁嗪烷基(1,2-oxazinanyl),作为例子;或7元环,例如氮杂环庚烷基、1,4-二氮杂环庚烷基或1,4-氧杂氮杂环庚烷基,作为例子;或双环7元环,例如6-氧杂-3-氮杂双环[3.1.1]庚烷,作为例子;或双环8元环,例如5,6-二氢-4*H*-呋喃并[2,3-*c*]吡咯或8-氧杂-3-氮杂双环[3.2.1]辛烷,作为例子;或双环9元环,例如八氢-1*H*-吡咯并[3,4-*b*]吡啶、1,3-二氢-异吡啶、2,3-二氢-吡啶或3,9-二氧杂-7-氮杂双环[3.3.1]壬烷,作为例子;或双环10元环,例如十氢喹啉或3,4-二氢异喹啉,作为例子。

[0092] 术语“杂螺环烷基”指总共具有6、7、8、9、10或11个环原子的双环饱和杂环,其中所述两个环共有-一个共同的环上的碳原子,其中“杂螺环烷基”含有一个或两个相同或不同的选自系列:N、O和S的环上杂原子;所述杂环螺烷基可能通过任何一个碳原子连接到分子的其余部分(除了螺碳原子),或者,如果存在的话,氮原子。

[0093] 所述杂螺环烷基是,例如,氮杂螺[2.3]己基、氮杂螺[3.3]庚基、氧杂氮杂螺[3.3]庚基、硫杂氮杂螺[3.3]庚基、氧杂螺[3.3]庚基、氧杂氮杂螺[5.3]壬基、氧杂氮杂螺[4.3]辛基、氧杂氮杂螺[2.5]辛基、氮杂螺[4.5]癸基、氧杂氮杂螺[5.5]十一烷基、二氮杂螺[3.3]庚基、硫杂氮杂螺[3.3]庚基、硫杂氮杂螺[4.3]辛基、氮杂螺[5.5]十一烷基,或其它同源构架之一例如螺[3.4]-、螺[4.4]-、螺[2.4]-、螺[2.5]-、螺[2.6]-、螺[3.5]-、螺

[3.6]-、螺[4.5]-和螺[4.6]-。

[0094] 术语“6-或10-元芳基”指一价的单环或双环芳族环,其具有6或10个碳环原子,例如苯基或萘基。

[0095] 术语“杂芳基”指一价的、单环、双环或三环芳族环,其具有5、6、9或10个环原子(“5-至10-元杂芳基”基团),特别是5或6个环原子(“5-至6-元杂芳基”基团),其含有至少一个环上杂原子和任选自系列:N、O 和/或 S的一个、两个或三个另外的环上杂原子,并且其经由环上碳原子或任选自氮原子(如果价态允许)而键合。

[0096] 所述杂芳基可以为5-元杂芳基,例如,作为例子,噻吩基、呋喃基、吡咯基、噁唑基、噻唑基、咪唑基、吡唑基、异噁唑基、异噻唑基、噁二唑基、三唑基、噻二唑基或四唑基;或6-元杂芳基,例如,作为例子,吡啶基、二氢吡啶基、哒嗪基、嘧啶基、四氢嘧啶基、吡嗪基或三嗪基。

[0097] 术语“杂环基”指选自杂环烷基和杂芳基的杂环。特别地,术语“4-至6-元杂环基”指选自4-至6-元杂环烷基和5-至6-元杂芳基的杂环。

[0098] 通常而言并且除非另有说明,所述杂芳基或亚杂芳基基团包括其所有可能的异构体形式,例如:互变异构体和在与分子剩余部分的连接点方面的位置异构体。因此,对于一些说明性的非限制性实例,术语吡啶基包括吡啶-2-基、吡啶-3-基和吡啶-4-基;或者,术语噻吩基包括噻吩-2-基和噻吩-3-基。

[0099] 如本本文中使用的,例如“C₁-C₄-烷基”、“C₁-C₄-卤代烷基”、“C₁-C₄-羟基烷基”、“C₁-C₄-烷氧基”或“C₁-C₄-卤代烷氧基”的定义的上下文中使用的术语“C₁-C₄”指具有1至4个有限数量的碳原子(即1、2、3或4个碳原子)的烷基。

[0100] 进一步,如本文中使用的,如本本文中、例如“C₃-C₆-环烷基”或C₃-C₆-卤代环烷基的定义的上下文中使用的术语“C₃-C₆”指具有3至6个有限数量的碳原子(即3、4、5或6个碳原子)的环烷基。

[0101] 在给定值的范围时,所述范围涵盖所述范围内的各个值和子范围。

[0102] 例如:

[0103] “C₁-C₄”涵盖C₁、C₂、C₃、C₄、C₁-C₄、C₁-C₃、C₁-C₂、C₂-C₄、C₂-C₃和C₃-C₄;

[0104] “C₂-C₆”涵盖C₂、C₃、C₄、C₅、C₆、C₂-C₆、C₂-C₅、C₂-C₄、C₂-C₃、C₃-C₆、C₃-C₅、C₃-C₄、C₄-C₆、C₄-C₅和C₅-C₆;

[0105] “C₃-C₄”涵盖C₃、C₄和C₃-C₄;

[0106] “C₃-C₁₀”涵盖C₃、C₄、C₅、C₆、C₇、C₈、C₉、C₁₀、C₃-C₁₀、C₃-C₉、C₃-C₈、C₃-C₇、C₃-C₆、C₃-C₅、C₃-C₄、C₄-C₁₀、C₄-C₉、C₄-C₈、C₄-C₇、C₄-C₆、C₄-C₅、C₅-C₁₀、C₅-C₉、C₅-C₈、C₅-C₇、C₅-C₆、C₆-C₁₀、C₆-C₉、C₆-C₈、C₆-C₇、C₇-C₁₀、C₇-C₉、C₇-C₈、C₈-C₁₀、C₈-C₉和C₉-C₁₀;

[0107] “C₃-C₈”涵盖C₃、C₄、C₅、C₆、C₇、C₈、C₃-C₈、C₃-C₇、C₃-C₆、C₃-C₅、C₃-C₄、C₄-C₈、C₄-C₇、C₄-C₆、C₄-C₅、C₅-C₈、C₅-C₇、C₅-C₆、C₆-C₈、C₆-C₇和C₇-C₈;

[0108] “C₃-C₆”涵盖C₃、C₄、C₅、C₆、C₃-C₆、C₃-C₅、C₃-C₄、C₄-C₆、C₄-C₅和C₅-C₆;

[0109] “C₄-C₈”涵盖C₄、C₅、C₆、C₇、C₈、C₄-C₈、C₄-C₇、C₄-C₆、C₄-C₅、C₅-C₈、C₅-C₇、C₅-C₆、C₆-C₈、C₆-C₇和C₇-C₈;

[0110] “C₄-C₇”涵盖C₄、C₅、C₆、C₇、C₄-C₇、C₄-C₆、C₄-C₅、C₅-C₇、C₅-C₆和C₆-C₇;

[0111] “C₄-C₆”涵盖C₄、C₅、C₆、C₄-C₆、C₄-C₅和C₅-C₆;

[0112] “C₅-C₁₀”涵盖C₅、C₆、C₇、C₈、C₉、C₁₀、C₅-C₁₀、C₅-C₉、C₅-C₈、C₅-C₇、C₅-C₆、C₆-C₁₀、C₆-C₉、C₆-C₈、C₆-C₇、C₇-C₁₀、C₇-C₉、C₇-C₈、C₈-C₁₀、C₈-C₉和C₉-C₁₀；

[0113] “C₆-C₁₀”涵盖C₆、C₇、C₈、C₉、C₁₀、C₆-C₁₀、C₆-C₉、C₆-C₈、C₆-C₇、C₇-C₁₀、C₇-C₉、C₇-C₈、C₈-C₁₀、C₈-C₉和C₉-C₁₀。

[0114] 如本文中使用的，术语“离去基团”指在化学反应中与其成键电子一起被替换为稳定种类的原子或原子的基团。特别地，这样的离去基团选自卤素，特别是氟、氯、溴或碘；(甲基磺酰基)氧基、[(三氟甲基)磺酰基]氧基、[(九氟丁基)磺酰基]氧基、(苯基磺酰基)氧基、[(4-甲基苯基)磺酰基]氧基、[(4-溴苯基)磺酰基]氧基、[(4-硝基苯基)磺酰基]氧基、[(2-硝基苯基)磺酰基]氧基、[(4-异丙基苯基)磺酰基]氧基、[(2,4,6-三异丙基苯基)磺酰基]氧基、[(2,4,6-三甲基苯基)磺酰基]氧基、[(4-叔丁基苯基)磺酰基]氧基和[(4-甲氧基苯基)磺酰基]氧基。

[0115] 本发明的上下文中的氧取代基指经由双键而键合于碳原子的氧原子。

[0116] 通式(I)的化合物可能以同位素变体形式存在。本发明因此包括通式(I)的化合物的一种或多种同位素变体，特别是含氘的通式(I)的化合物。

[0117] 化合物或试剂的术语“同位素变体”被定义为表现出构成这样的化合物的一种或多种同位素的非天然比例的化合物。

[0118] 术语“通式(I)的化合物的同位素变体”被定义为表现出构成这样的化合物的一种或多种同位素的非天然比例的同式(I)的化合物。

[0119] 表达“非天然比例”指高于其天然丰度的这样的同位素的比例。应用于该上下文中的同位素的天然丰度被描述于“Isotopic Compositions of the Elements 1997”, Pure Appl. Chem., 70 (1), 217-235, 1998。

[0120] 这样的同位素的实例包括氢、碳、氮、氧、磷、硫、氟、氯、溴和碘的稳定的和放射性的同位素，分别诸如²H (氘)、³H (氚)、¹¹C、¹³C、¹⁴C、¹⁵N、¹⁷O、¹⁸O、³²P、³³P、³³S、³⁴S、³⁵S、³⁶S、¹⁸F、³⁶Cl、⁸²Br、¹²³I、¹²⁴I、¹²⁵I、¹²⁹I和¹³¹I。

[0121] 针对治疗和/或预防本文中所指出的病症，通式(I)的化合物的一种或多种同位素变体优选含有氘(“含氘的通式(I)的化合物”)。其中并入了一种或多种诸如³H或¹⁴C的放射性同位素的通式(I)的化合物的同位素变体可用于例如药物和/或底物组织(substrate tissue)分布研究。这些同位素因其易于并入和可检测性而特别优选。可以将正电子发射同位素诸如¹⁸F或¹¹C并入通式(I)的化合物中。这些通式(I)的化合物的同位素变体可用于体内成像应用。含氘和含¹³C的通式(I)的化合物可以用于在临床前或临床研究的背景下的质谱分析。

[0122] 通式(I)的化合物的同位素变体通常可以通过本领域技术人员已知的方法，诸如在本文中的方案和/或实施例中描述的那些，通过将试剂替换为所述试剂的同位素变体，优选含氘的试剂来制备。取决于期望的氘代位点，在一些情况中，可以将来自D₂O的氘直接并入化合物中，或并入对于合成这样的化合物而言有用的试剂中。氘气也是对于将氘并入分子中而言有用的试剂。烯键和炔键的催化氘化是对于并入氘而言的快速途径。氘气存在下的金属催化剂(即Pd、Pt和Rh)可以用于直接在含官能团的烃中将氢置换为氘。多种氘代试剂和合成构件可以从公司商购获得，所述公司诸如例如C/D/N Isotopes, Quebec, Canada; Cambridge Isotope Laboratories Inc., Andover, MA, USA; 和CombiPhos Catalysts,

Inc., Princeton, NJ, USA.

[0123] 术语“含氘的通式 (I) 的化合物”被定义为通式 (I) 的化合物, 其中一个或多个氢原子被一个或多个氘原子替代, 并且其中通式 (I) 的化合物的各氘代位置处的氘的丰度高于氘的天然丰度, 其为约 0.015%。特别地, 含氘的通式 (I) 的化合物中, 通式 (I) 的化合物的各氘代位置处的氘的丰度高于 10%、20%、30%、40%、50%、60%、70% 或 80%, 优选在一个或多个所述位置处高于 90%、95%、96% 或 97%, 甚至更优选在一个或多个所述位置处高于 98% 或 99%。要理解的是, 在各氘代位置处的氘的丰度独立于其它的一个或多个氘代位置处的氘的丰度。

[0124] 将一个或多个氘原子选择性地并入通式 (I) 的化合物可能改变分子的物理化学特性 (诸如例如酸性 [C. L. Perrin 等人, *J. Am. Chem. Soc.*, 2007, 129, 4490]、碱性 [C. L. Perrin 等人, *J. Am. Chem. Soc.*, 2005, 127, 9641]、亲脂性 [B. Testa 等人, *Int. J. Pharm.*, 1984, 19 (3), 271]) 和/或代谢曲线, 并且可能导致母体化合物对代谢物的比例的改变或所形成的代谢物的量的改变。这样的改变可能导致某些治疗优点, 并且因此在一些情况中是优选的。已报道了其中改变了代谢物比例的减少的代谢速率和代谢转换 (A. E. Mutlib 等人, *Toxicol. Appl. Pharmacol.*, 2000, 169, 102)。这些在暴露于母体药物和代谢物时的改变对含氘的通式 (I) 的化合物的药效学、耐受性和效能而言可以具有重要的结果。在一些情况中, 氘取代减少或消除了不期望或有毒性的代谢物的形成, 并且提高了期望的代谢物的形成 (例如奈韦拉平 (Nevirapine): A. M. Sharma 等人, *Chem. Res. Toxicol.*, 2013, 26, 410; 依法韦仑 (Efavirenz): A. E. Mutlib 等人, *Toxicol. Appl. Pharmacol.*, 2000, 169, 102)。在另外的情况中, 氘代的主要效果是减少系统清除率。其结果是, 提高了化合物的生物半衰期。潜在的临床益处可能包括以减少的峰浓度和增加的谷浓度来维持相似系统暴露的能力。取决于特定化合物的药代动力学/药效学关系, 这可以引起更低的副作用和提高的效能。ML-337 (C. J. Wenthur 等人, *J. Med. Chem.*, 2013, 56, 5208) 和奥当卡替 (Odanacatib) (K. Kassahun 等人, W02012/112363) 是该氘效果的实例。还报告了另外其它的情况, 其中降低的代谢率导致药物暴露的增加而不改变系统清除率 (例如罗非考昔 (Rofecoxib): F. Schneider 等人, *Arzneim. Forsch./ Drug. Res.*, 2006, 56, 295; 特拉匹韦 (Telaprevir): F. Maltais 等人, *J. Med. Chem.*, 2009, 52, 7993)。显示出该效果的氘代药物可以具有减少的剂量要求 (例如更低的剂量数或更低的剂量以实现期望效果) 和/或可以产生更低的代谢物负载。

[0125] 通式 (I) 的化合物可以具有多个潜在的代谢攻击位点。为了优化对物理化学特性和代谢曲线的上述效果, 可以选择具有一种或多种氘-氢交换中某一模式的含氘的通式 (I) 的化合物。特别地, 一种或多种通式 (I) 的含氘的化合物的一个或多个氘原子连接于碳原子, 和/或位于作为代谢酶 (诸如细胞色素 P₄₅₀) 的攻击位点的通式 (I) 的化合物的那些位置。

[0126] 在本文中使用词语化合物、盐、多晶型物、水合物、溶剂合物等的复数形式的情况下, 其也指单一的化合物、盐、多晶型物、异构体、水合物、溶剂合物等。

[0127] “稳定的化合物”或“稳定的结构”指充分稳健以经受从反应混合物分离至有用纯度和配制为有效治疗剂的化合物。

[0128] 本发明的化合物任选含有一个或多个不对称中心, 这取决于所期望的多个取代基的位置和性质。一个或多个不对称碳原子可能以 (R) 或 (S) 构型存在, 其可以在单一不对称中心的情况中导致外消旋混合物, 并且在多个不对称中心的情况中导致非对映异构混合

物。在某些情况中,还可能由于围绕给定键(例如指定化合物的邻接两个取代芳族环的中心键)的受限旋转而存在不对称性。

[0129] 优选的化合物是产生更期望的生物活性的那些。本发明化合物的分离的、纯的或部分纯化的异构体和立体异构体、或者外消旋或非对映异构混合物也被包括在本发明的范围内。这样的材料的纯化和分离可以通过本领域已知的标准技术而完成。

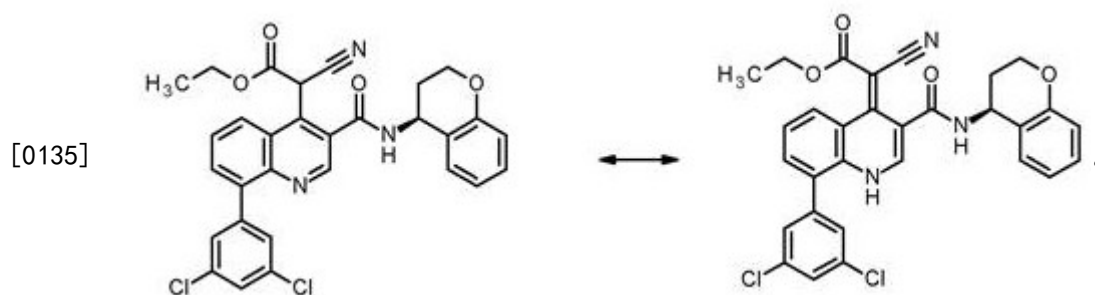
[0130] 优选的异构体是产生更期望的生物活性的那些。本发明的化合物的这些分离的、纯的或部分纯化的异构体、或者外消旋混合物也被包括在本发明的范围内。这样的材料的纯化和分离可以通过本领域已知的标准技术而完成。

[0131] 光学异构体可以通过根据常规方法来拆分外消旋混合物而获得,例如通过使用光学活性的酸或碱形成非对映异构盐、或者形成共价非对映异构体。适合的酸的实例是酒石酸、二乙酰基酒石酸、二甲苯酰酒石酸和樟脑磺酸。非对映异构体的混合物可以基于其物理和/或化学的差异,通过本领域已知的方法,例如通过色谱或分步结晶,从而被分离为其单独的非对映异构体。然后将光学活性的碱或酸从分离的非对映异构盐释放出来。用于分离光学异构体的不同方法涉及在有或没有常规衍生化的情况下使用手性色谱(例如使用手性相的HPLC柱),进行最佳选择以使得对映异构体的分离最大化。适合的使用手性相的HPLC柱是商购可得的,诸如由Daicel制造的那些,例如Chiracel OD和Chiracel OJ,如其中均可常规选择的。具有或不具有衍生化的酶分离也是有用的。本发明的光学活性的化合物可以同样的通过利用光学活性的起始材料的手性合成而获得。

[0132] 为了区分彼此不同类型的异构体,参照IUPAC规则E部分(Pure Appl Chem 45,11-30,1976)。

[0133] 本发明包括单一立体异构体形式,或者任意比例的所述立体异构体(例如(R)-或(S)-异构体)的任意混合物形式的本发明的化合物的所有可能的立体异构体。例如,本发明的化合物的单一立体异构体(例如单一对映异构体或单一非对映异构体)的分离通过现有技术方法的任何适合状态(诸如色谱,尤其是手性色谱,作为例子)而实现。

[0134] 此外,本发明的化合物可能作为互变异构体存在。例如,含有产生具有增加的C-H酸度的在喹啉上的 α -CH-部分的取代模式的本发明的任何化合物可以作为1,4-二氢喹啉互变异构体,或者甚至两种互变异构体的任何量的混合物存在,即:



[0136] 本发明包括作为单一互变异构体,或者作为任意比例的所述互变异构体的任意混合物的本发明的化合物的所有可能的互变异构体。

[0137] 进一步,本发明的化合物可能以N-氧化物存在,其被定义为本发明的化合物的至少一个氮被氧化。本发明包括所有这样的可能的N-氧化物。

[0138] 本发明还涵盖本发明的化合物的有用形式,诸如代谢物、水合物、溶剂合物、前药、

盐(特别是药学上可接受的盐)和/或共沉淀物。

[0139] 本发明的化合物可能以水合物或溶剂合物的形式存在,其中本发明的化合物含有极性溶剂(特别是例如水、甲醇或乙醇)作为化合物晶格的结构要素。极性溶剂(特别是水)的量可能以化学计量或非化学计量的比例存在。在化学计量的溶剂合物的情况中,例如水合物、半-(hemi-)、(半-) (semi-)、单-、倍半-、二-、三-、四-、五-等溶剂合物或水合物分别是可能的。本发明包括所有这样的水合物或溶剂合物。

[0140] 进一步,本发明的化合物可能以游离形式(例如以游离碱、或以游离酸、或以两性离子)存在,或者以盐的形式存在。所述盐可以是任意盐,是有机或无机加成盐,特别是任意药学上可接受的有机或无机加成盐,其在药学中通常使用,或其例如用于分离或纯化本发明的化合物。

[0141] 术语“药学上可接受的盐”指本发明的化合物的无机或有机酸加成盐。例如参见S. M. Berge等人,“Pharmaceutical Salts,”J. Pharm.Sci.1977,66,1-19。

[0142] 本发明的化合物的适合的药学上可接受的盐可以是例如在链中或在环中带有氮原子的例如充分碱性的本发明的化合物的酸加成盐,诸如:与无机酸或“矿物酸”,如盐酸、氢溴酸、氢碘酸、硫酸、氨基磺酸、重硫酸(bisulfuric acid)、磷酸,或硝酸的酸加成盐,作为例子;或者与有机酸,如甲酸、乙酸、乙酰乙酸、丙酮酸、三氟乙酸、丙酸、丁酸、己酸、庚酸、十一烷酸、月桂酸、苯甲酸、水杨酸、2-(4-羟基苯甲酰基)-苯甲酸、樟脑酸、肉桂酸、环戊烷丙酸、二葡萄糖酸、3-羟基-2-萘甲酸、烟酸、扑酸、果胶酯酸、3-苯基丙酸、特戊酸、2-羟基乙磺酸、衣康酸、三氟甲磺酸、十二烷基硫酸、乙磺酸、苯磺酸、对甲苯磺酸、甲磺酸、2-萘磺酸、萘二磺酸、樟脑磺酸、柠檬酸、酒石酸、硬脂酸、乳酸、草酸、丙二酸、丁二酸、苹果酸、己二酸、藻酸、马来酸、富马酸、D-葡萄糖酸、扁桃酸、抗坏血酸、葡庚酸、甘油磷酸、天冬氨酸、磺基水杨酸,或硫氰酸的酸加成盐,作为例子。

[0143] 进一步,充分酸性的本发明的化合物的另外适合的药学上可接受的盐是碱金属盐,例如钠或钾盐;碱土金属盐,例如钙、镁或锶盐;或者铝或锌盐;或者铵盐,其衍生自氨或具有1至20个碳原子的有机伯、仲或叔胺,诸如乙胺、二乙胺、三乙胺、乙基二异丙基胺、单乙醇胺、二乙醇胺、三乙醇胺、二环己基胺、二甲基氨基乙醇、二乙基氨基乙醇、三(羟基甲基)氨基甲烷、普鲁卡因、二苄基胺、N-甲基吗啉、精氨酸、赖氨酸、1,2-乙二胺、N-甲基哌啶、N-甲基-葡萄糖胺、N,N-二甲基-葡萄糖胺、N-乙基-葡萄糖胺、1,6-己二胺、氨基葡萄糖、肌氨酸、丝氨酸、2-氨基-1,3-丙二醇、3-氨基-1,2-丙二醇、4-氨基-1,2,3-丁三醇;或者与具有1至20个碳原子的季铵离子、诸如四甲基铵、四乙基铵、四(正丙基)铵、四(正丁基)铵、N-苄基-N,N,N-三甲基铵、胆碱或苄烷铵形成的盐。

[0144] 本领域技术人员将进一步认识到,要求保护的化合物的酸加成盐可能经由多种已知方法中的任一种通过使化合物与适合的无机或有机酸反应而制备。替代地,本发明的酸性化合物的碱金属和碱土金属盐经由多种已知方法通过使本发明的化合物与适合的碱反应而制备。

[0145] 本发明包括作为单一盐、或者作为任意比例的所述盐的任意混合物的本发明的化合物的所有可能的盐。

[0146] 在本文中,特别是在实验部分中,为了合成本发明的中间体和实施例,当化合物被提及为与相应的碱或酸形成的盐形式时,由各制备和/或纯化方法所得到的所述盐形式

的准确化学计量组成在大多数情况中是未知的。

[0147] 除非另有说明,与盐相关的化学名称或结构式的后缀,诸如“盐酸盐”、“三氟乙酸盐”、“钠盐”,或“x HCl”、“x CF₃COOH”、“x Na⁺”,作为例子,指盐形式,所述盐形式的化学计量没有指定。

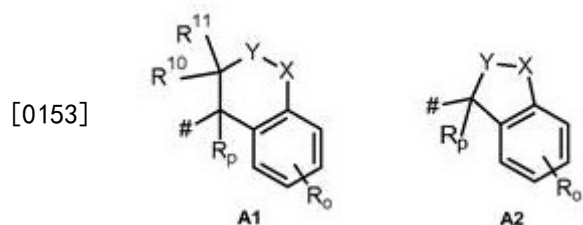
[0148] 这类似地应用于下述情况:其中已通过所描述的制备和/或纯化方法获得了作为溶剂合物(诸如水合物)的合成中间体或实施例化合物或其盐,其具有(如果定义)未知的化学计量组成。

[0149] 进一步,本发明包括本发明化合物的所有可能的结晶形式或多晶型物,为单一多晶型物,或为任意比例的多于一种多晶型物的混合物。

[0150] 另外,本发明还包括根据本发明化合物的前药。术语“前药”在此指代下述化合物,其本身可以是生物活性或无活性的,但在其在体内滞留时间期间转化(例如代谢地或水解地)为根据本发明的化合物。

[0151] 根据第一方面的第二实施方案,本发明涵盖上述通式(I)的化合物,其中:

[0152] A 是A1或A2,



[0154] o 是0、1、2、3或4,

[0155] R 选自氢、卤素、氰基、硝基、-OH、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基,

[0156] R_p 选自氢、C₁-C₄-烷基,

[0157] X、Y 独立地选自CR⁷R⁸、O、S和N-R⁹,其中X和Y中的至少一个是CR⁷R⁸,或

[0158] X、Y 一起形成选自以下的环成员:-C(O)-O-、-C(O)-NR⁹-、-S(O)-NR⁹-、-SO₂-NR⁹-和-SO₂-O-

[0159] R¹ 选自氢、氰基、-CHO、-OH、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、具有1至5个卤素原子的C₃-C₆-卤代环烷基、C₃-C₄-烯基、C₃-C₄-炔基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基-C₁-C₃-烷基、氰基-C₁-C₄-烷基、-NH-C₁-C₄-烷基、-N(C₁-C₄-烷基)₂、NH₂-C₁-C₄-烷基、-C₁-C₄-烷基-NH-C₁-C₄-烷基、(C₁-C₄-烷基)₂N-C₁-C₄-烷基、-C₁-C₄-烷基-C(O)-、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基-C(O)-、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、苄氧基-C(O)-、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基-C(O)-、-SO₂-C₁-C₄-烷基、和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基;

[0160] 苯基-C₁-C₄-烷基,任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、-NO₂、氰基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-

C_4 -烷基、 $-SO_2-C_1-C_4$ -烷基、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4$ -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4$ -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4$ -卤代烷基；

[0161] 杂环基- C_1-C_4 -烷基，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、氰基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4$ -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4$ -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4$ -卤代烷基，

[0162] R^2 选自

[0163] 氢、卤素、氰基、 $-COOH$ 、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ ；

[0164] $-NR^{12}R^{13}$ ；

[0165] $-OR^{14}$ ；

[0166] $-SR^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-SO_2R^{15}$ ；

[0167] C_1-C_6 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_3-C_6 -环烯基、 C_2-C_4 -炔基或苯基- C_1-C_4 -烷基，其各自任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、氰基、 C_1-C_4 -烷基- $C(O)-$ 、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-NH(C(O)-C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)(C(O)-C_1-C_4-烷基)$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4$ -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4$ -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4$ -卤代烷基；

[0168] 杂环基- C_1-C_4 -烷基，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-OH$ 、 $-NO_2$ 、氰基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4$ -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4$ -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4$ -卤代烷基；

[0169] 苯基，其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、 $-OH$ 、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4$ -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4$ -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4$ -卤代烷基；

[0170] 选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、杂螺环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、 $-OH$ 、氧代、硫羰基、 $-COOH$ 、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基- $C(O)-$ 、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羟基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基-、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-$

C_1-C_4 -烷基、 $-SO_2-C_1-C_4$ -烷基、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4$ -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4$ -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4$ -卤代烷基和4-至10-元杂环烷基，

[0171] R^3 是氢，或 C_1-C_4 -烷基，

[0172] R^4 选自氢、卤素、 $-OH$ 、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ ，

[0173] R^5 选自氢、卤素、 $-OH$ 、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ ，

[0174] R^6 选自氢、卤素、 $-OH$ 、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ ，

[0175] R^7 选自氢、 $-OH$ 、氟、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，

[0176] R^8 选自氢、 $-OH$ 、氟、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，

[0177] 或者 R^7 和 R^8 一起形成氧代基团(=O)，

[0178] R^9 选自氢、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，

[0179] R^{10} 选自氢、 $-OH$ 、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，

[0180] R^{11} 选自氢、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，

[0181] R^{12} 和 R^{13} 独立地选自

[0182] 氢、 $-OH$ 、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-NH(-C(O)-C_1-C_4-烷基)$ 、 C_1-C_4 -烷氧基；

[0183] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-OH$ 、氰基、 $-COOH$ 、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-NH-C(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)-(-C(O)-C_1-C_4-烷基)$ 、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4$ -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4$ -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4$ -卤代烷基和 $(C_1-C_4-烷氧基)_2P(=O)-$ ；

[0184] 杂环基- C_1-C_4 -烷基，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、 $-OH$ 、氧代、硫羰基、 $-COOH$ 、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羧基- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4$ -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4$ -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4$ -卤代烷基；

[0185] 苯基、苯并- C_5-C_6 -环烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取

代:卤素、氰基、硝基、-OH、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基;和

[0186] 选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C_1-C_4 -烷基)、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羟基- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基,

[0187] R¹⁴ 选自

[0188] -NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂;

[0189] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C_1-C_4 -烷基)、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基;

[0190] 杂环基- C_1-C_4 -烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C_1-C_4 -烷基)、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羟基- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基;

[0191] 苯基,其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、硝基、-OH、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基;和

[0192] 选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C_1-C_4 -烷基)、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羟基- C_1-C_4 -烷基、具有1

至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4-卤代烷基$ 和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4-卤代烷基$ ，

[0193] R^{15} 选自

[0194] 氢；

[0195] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-OH$ 、氰基、 $-COOH$ 、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4-卤代烷基$ 和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4-卤代烷基$ ；

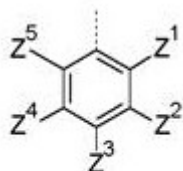
[0196] 杂环基- C_1-C_4 -烷基，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、 $-OH$ 、氧代、硫羰基、 $-COOH$ 、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羟基- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4-卤代烷基$ 和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4-卤代烷基$ ；

[0197] 苯基，其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、 $-OH$ 、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4-卤代烷基$ 和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4-卤代烷基$ ；和

[0198] 选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、硝基、 $-OH$ 、氧代、硫羰基、 $-COOH$ 、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羟基- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4-卤代烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4-卤代烷基$ 和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4-卤代烷基$ ，

[0199] Q 是式(Q1)的取代的苯基环

[0200]



(Q1)

[0201] 其中:

[0202] Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 Z^4 、和 Z^5 独立地选自氢、卤素、 SF_5 、氰基、-CHO、硝基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、羟基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷氧基、氰基- C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、-NH-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基)、-N(SO₂-[C_1 - C_4 -烷基])(C_1 - C_4 -烷基)、(C_1 - C_4 -烷氧基亚氨基)- C_1 - C_4 -烷基、任选地被1或2个选自氟、氯、溴、甲基和氰基的取代基取代的4-至6-元杂环基、-CH₂-O-(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、被4-至6-元杂环基取代的甲基,所述4-至6-元杂环基本身任选地被1或2个选自氟、氯、溴、甲基和氰基的取代基取代、-CH₂-S-(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-S(O)-(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基)、-S-(C_1 - C_4 -烷基)、-S(O)-(C_1 - C_4 -烷基)、-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基)、具有1至5个卤素原子的-S-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-S(O)-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-SO₂-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、-CONH(C_1 - C_4 -烷基)、-CONH(C_3 - C_6 -环烷基)、-NHC(O)(C_1 - C_4 -烷基)、-NHC(O)(C_3 - C_6 -环烷基)、具有1至5个卤素原子的-NHC(O)(C_1 - C_4 -卤代烷基),或

[0203] Z^1 和 Z^2 与它们所连接的碳原子一起形成5-或6-元的饱和或部分饱和的杂环、5-元杂芳基、或6-元杂芳基,其各自可任选地被一个或两个选自下述的取代基取代:甲基、氟和氧代,和

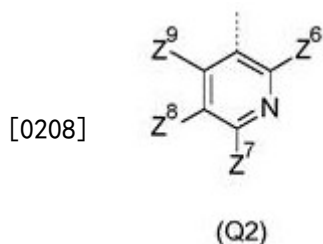
[0204] Z^3 、 Z^4 、和 Z^5 独立地选自氢、卤素、 SF_5 、氰基、CHO、硝基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、羟基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷氧基、氰基- C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基-C(O)-、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、-NH-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基)、-N(SO₂-[C_1 - C_4 -烷基])(C_1 - C_4 -烷基)、(C_1 - C_4 -烷氧基亚氨基)- C_1 - C_4 -烷基、任选地被1或2个选自氟、甲基或氰基的取代基取代的4-至6-元杂环烷基、-CH₂-O-(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、被4-至6-元杂环烷基取代的甲基,所述4-至6-元杂环烷基基本身任选地被1或2个选自氟、甲基或氰基的取代基取代、-CH₂-S-(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-S(O)-(C_1 - C_4 -烷基)、-CH₂-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基)、-S-(C_1 - C_4 -烷基)、-S(O)-(C_1 - C_4 -烷基)、-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基)、具有1至5个卤素原子的-S-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-S(O)-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-SO₂-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、-CONH(C_1 - C_4 -烷基)、-CONH(C_3 - C_6 -环烷基)、-NHC(O)(C_1 - C_4 -烷基)、-NHC(O)(C_3 - C_6 -环烷基)、具有1至5个卤素原子的-NHC(O)(C_1 - C_4 -卤代烷基),或

[0205] Z^2 和 Z^3 与它们所连接的碳原子一起形成5-或6-元的饱和或部分饱和的杂环、5-元杂芳基或6-元杂芳基,其各自可任选地被一个或两个选自下述的取代基取代:甲基、氟和氧代,和

[0206] Z^1 、 Z^4 、和 Z^5 独立地选自氢、卤素、 SF_5 、氰基、CHO、硝基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、羟基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_3 - C_6 -环烷基- C_1 - C_4 -烷氧基、氰基- C_1 - C_4 -烷

氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-NH-SO_2-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(SO_2-[C_1-C_4-烷基])(C_1-C_4-烷基)$ 、 $(C_1-C_4-烷氧基亚氨基)-C_1-C_4-烷基$ 、任选地被1或2个选自氟、甲基或氰基的取代基取代的4-至6-元杂环烷基、 $-CH_2-O-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-CH_2-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-CH_2-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、被4-至6-元杂环烷基取代的甲基,所述4-至6-元杂环烷基本身任选地被1或2个选自氟、甲基或氰基的取代基取代、 $-CH_2-S-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-CH_2-S(O)-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-CH_2-SO_2-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-S-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-S(O)-(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-SO_2-(C_1-C_4-烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-(C_1-C_4-卤代烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-(C_1-C_4-卤代烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-(C_1-C_4-卤代烷基)$ 、 $-CONH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-CONH(C_3-C_6-环烷基)$ 、 $-NHC(O)(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-NHC(O)(C_3-C_6-环烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-NHC(O)(C_1-C_4-卤代烷基)$,或

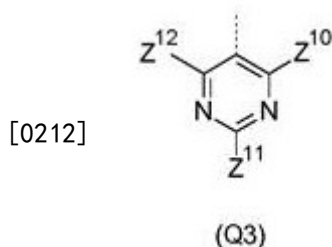
[0207] Q 是式(Q2)的吡啶环



[0209] 其中:

[0210] Z^6 、 Z^7 、 Z^8 和 Z^9 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$,或

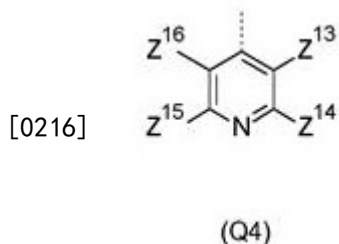
[0211] Q 是式(Q3)的嘧啶环



[0213] 其中:

[0214] Z^{10} 、 Z^{11} 和 Z^{12} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$,或

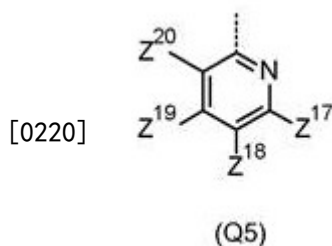
[0215] Q 是式(Q4)的吡啶环



[0217] 其中:

[0218] Z^{13} 、 Z^{14} 、 Z^{15} 和 Z^{16} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_1 - C_4 -羟基烷基、 NH_2 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-NH-CO-C_1-C_4-烷基$ ，和选自下述的单环杂环：4-7元杂环烷基或具有至少一个氮原子的5-元杂芳基，所述杂芳基环通过该氮原子与所述吡啶环相连，其各自任选地被1、2或3个独立地选自下述的取代基取代：卤素、氰基、硝基、 $-OH$ 、氧代、硫羰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_3 - C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-(C_1-C_4-卤代烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-(C_1-C_4-卤代烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-(C_1-C_4-卤代烷基)$ ，或

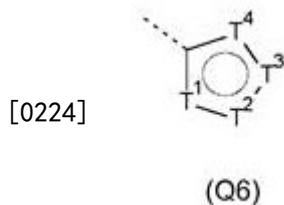
[0219] Q 是式 (Q5) 的吡啶环



[0221] 其中：

[0222] Z^{17} 、 Z^{18} 、 Z^{19} 和 Z^{20} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ ，或

[0223] Q 是式 (Q6) 的5-元芳族杂环



[0225] 其中：

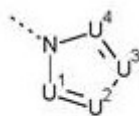
[0226] T^1 - T^4 独立地选自N、O、S、C- Z^{21} 和N- Z^{22} ，其中 T^1 - T^4 中不超过一个是O， T^1 - T^4 中不超过一个是S， T^1 - T^4 中不超过一个是N- Z^{22} ，并且其中

[0227] 每个 Z^{21} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基，和

[0228] 每个 Z^{22} 独立地选自氢、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷基- C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基，或

[0229] Q 是式 (Q7) 的5-元芳族杂环

[0230]



(Q7)

[0231] 其中:

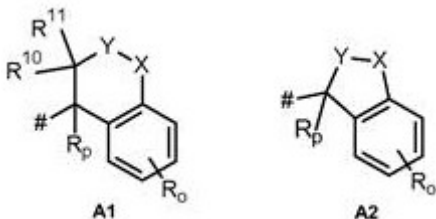
[0232] $U^1 - U^4$ 独立地选自N和C- Z^{23} , 其中 $U^1 - U^4$ 中不超过三个是N, 并且其中[0233] 每个 Z^{23} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基,[0234] 其中当Y是O、S或N- R^9 时, R^7 、 R^8 、 R^{10} 和 R^{11} 中没有一个是-OH, 并且其中当X是O、S或N- R^9 时, R^7 和 R^8 中没有一个是-OH,

[0235] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐, 以及它们的混合物。

[0236] 根据第一方面的第三实施方案, 本发明涵盖上述通式(I)的化合物, 其中:

[0237] A 是A1或A2,

[0238]



[0239] o 是0、1或2,

[0240] R 选自卤素、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基、氰基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基,[0241] R_p 选自氢、 C_1-C_4 -烷基,[0242] X、Y 独立地选自 CR^7R^8 、O、S、和N- R^9 , 其中X和Y中的至少一个是 CR^7R^8 ,[0243] R^1 选自氢、 C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_4 -烯基、 C_3-C_4 -炔基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基- C_1-C_3 -烷基、氰基- C_1-C_4 -烷基,[0244] R^2 选自[0245] 氢、卤素、氰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C_1-C_4 -烷基)、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂;[0246] -NR¹²R¹³;[0247] -OR¹⁴;[0248] -SR¹⁵、-S(O)R¹⁵、-SO₂R¹⁵;[0249] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_3-C_6 -环烯基、 C_2-C_4 -炔基或苯基- C_1-C_4 -烷基, 其各自任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代: 卤素、-OH、氰基、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C_1-C_4 -烷基)、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-NH(C(O)- C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)(C(O)- C_1-C_4 -烷基)、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S

(O)-C₁-C₄-卤代烷基和具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基;和

[0250] 选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、杂螺环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、-OH、氧代、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基-C(O)-、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、羟基-C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基-、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂和4-至10-元杂环烷基,

[0251] R³ 是氢或C₁-C₄-烷基,

[0252] R⁴ 选自氢、卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂,

[0253] R⁵ 选自氢、卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂,

[0254] R⁶ 选自氢、卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂,

[0255] R⁷ 选自氢和C₁-C₄-烷基,

[0256] R⁸ 选自氢和C₁-C₄-烷基,

[0257] 或者R⁷ 和R⁸ 一起形成氧代基团(=O),

[0258] R⁹ 是C₁-C₄-烷基,

[0259] R¹⁰ 选自氢、-OH、C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-烷氧基,

[0260] R¹¹ 是氢,

[0261] R¹² 和R¹³ 独立地选自

[0262] 氢、-NH(-C(O)-C₁-C₄-烷基)、C₁-C₄-烷氧基;

[0263] C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、苯基-C₁-C₄-烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氰基、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C₁-C₄-烷基)、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂、-NH-C(O)-C₁-C₄-烷基、-N(C₁-C₄-烷基)-(-C(O)-C₁-C₄-烷基)、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基、-NH₂、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)-C₁-C₄-卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-SO₂-C₁-C₄-卤代烷基和(C₁-C₄-烷氧基)₂P(=O)-;

[0264] 杂环基-C₁-C₄-烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、-OH、氧代、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基;

[0265] 苯基、苯并-C₅-C₆-环烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至

5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基;和

[0266] 选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、-OH、氧代、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基,

[0267] R¹⁴ 选自

[0268] C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、苯基-C₁-C₄-烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基;和

[0269] 杂环基-C₁-C₄-烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、-OH、氧代、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基;

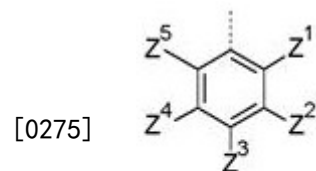
[0270] R¹⁵ 选自

[0271] 氢;

[0272] C₁-C₄-烷基、苯基-C₁-C₄-烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基;

[0273] 杂环基-C₁-C₄-烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基;

[0274] Q 是式(Q1)的取代的苯基环



(Q1)

[0276] 其中:

[0277] Z¹、Z²、Z³、Z⁴、和Z⁵ 独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、羟基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂、任选地被1或2个选自氟、氯、溴、甲基和氰基的取代基取代的4-至6-元杂环基、-S-(C₁-C₄-烷基)、-S(O)-(C₁-C₄-烷基)、-SO₂-(C₁-C₄-烷基),或

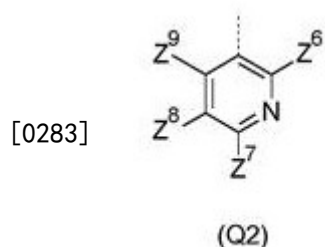
[0278] Z¹ 和Z² 与它们所连接的碳原子一起形成5或6元的杂环烷基、5-元杂芳基或6-元杂芳基,其各自可任选地被一个或两个选自下述的取代基取代:甲基、氟和氧代,和

[0279] Z³、Z⁴、和Z⁵ 独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基,或

[0280] Z^2 和 Z^3 与它们所连接的碳原子一起形成5-或6-元的饱和或部分饱和的杂环、5-元杂芳基或6-元杂芳基,其各自可任选地被一个或两个选自下述的取代基取代:甲基、氟和氧代,和

[0281] Z^1 、 Z^4 、和 Z^5 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基,或

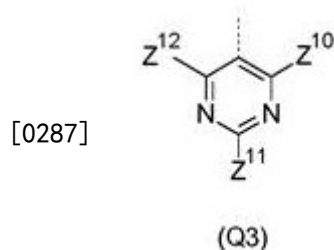
[0282] Q 是式 (Q2) 的吡啶环



[0284] 其中:

[0285] Z^6 、 Z^7 、 Z^8 和 Z^9 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$,或

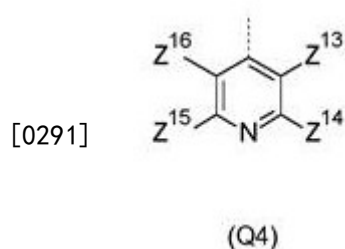
[0286] Q 是式 (Q3) 的嘧啶环



[0288] 其中:

[0289] Z^{10} 、 Z^{11} 和 Z^{12} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$,或

[0290] Q 是式 (Q4) 的吡啶环

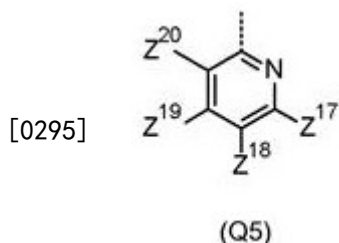


[0292] 其中:

[0293] Z^{13} 、 Z^{14} 、 Z^{15} 和 Z^{16} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_1 - C_4 -羟基烷基、 NH_2 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-NH-CO-C_1-C_4-烷基$,和选自下述的单环杂环:4-至7-元杂环烷基或具有至少一个氮原子的5-元杂芳基,所述杂芳基环通过该氮原子与所述吡

啉环相连,其各自任选地被1、2或3个独立地选自下述的取代基取代:卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-(C_1-C_4-卤代烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-(C_1-C_4-卤代烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-(C_1-C_4-卤代烷基)$,或

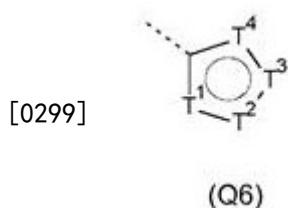
[0294] Q 是式(Q5)的吡啶环



[0296] 其中:

[0297] Z^{17} 、 Z^{18} 、 Z^{19} 和 Z^{20} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$,或

[0298] Q 是式(Q6)的5元芳族杂环



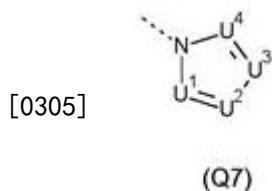
[0300] 其中:

[0301] T^1-T^4 独立地选自N、O、S、C- Z^{21} 和N- Z^{22} ,其中 T^1-T^4 中不超过一个是O, T^1-T^4 中不超过一个是S, T^1-T^4 中不超过一个是N- Z^{22} ,并且其中

[0302] 每个 Z^{21} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基,和

[0303] 每个 Z^{22} 独立地选自氢、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷基- C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基,或

[0304] Q 是式(Q7)的5元芳族杂环

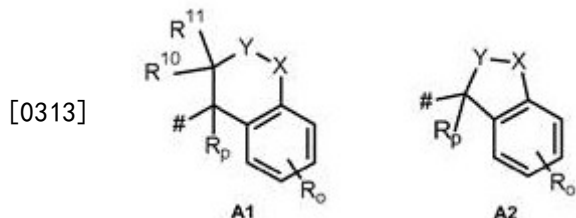


[0306] 其中:

[0307] U^1-U^4 独立地选自N和C- Z^{23} ,其中 U^1-U^4 中不超过三个是N,并且其中

[0308] 每个 Z^{23} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基,

- [0309] 其中当Y是O、S或N-R⁹时，R¹⁰不是-OH，
 [0310] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐，以及它们的混合物。
 [0311] 根据第一方面的第四实施方案，本发明涵盖上述通式(I)的化合物，其中：
 [0312] A 是A1或A2，



- [0314] o 是0、1或2，
 [0315] R 选自卤素、C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-烷氧基，
 [0316] R_p 选自氢、C₁-C₄-烷基，
 [0317] X 选自CR⁷R⁸、O、S、和N-R⁹，
 [0318] Y 是CR⁷R⁸或O，
 [0319] R¹ 是氢或C₁-C₄-烷基，
 [0320] R² 选自
 [0321] 氢、卤素、-C(O)-N(C₁-C₄-烷基)₂；
 [0322] -NR¹²R¹³；
 [0323] -OR¹⁴；
 [0324] -SR¹⁵、-S(O)R¹⁵、-SO₂R¹⁵；
 [0325] C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₂-C₄-烯基或C₃-C₆-环烯基，其各自任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代：卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-和-C(O)-NH₂、C₁-C₄-烷氧基、-NH₂、-N(C₁-C₄-烷基)₂、-N(C₁-C₄-烷基)(C(O)-C₁-C₄-烷基)；和
 [0326] 选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、杂螺环烷基、5-元杂芳基、和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代：卤素、-OH、氧代、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基-C(O)-、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、羟基-C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基-、-NH₂、-N(C₁-C₄-烷基)₂、和4-至10-元杂环烷基，
 [0327] R³ 是氢或C₁-C₄-烷基，
 [0328] R⁴ 选自氢、卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH₂，
 [0329] R⁵ 选自氢、卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基，
 [0330] R⁶ 选自氢、卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基，
 [0331] R⁷ 选自氢和C₁-C₄-烷基，
 [0332] R⁸ 选自氢和C₁-C₄-烷基，
 [0333] 或者R⁷ 和R⁸ 一起形成氧代基团(=O)，

[0334] R^9 是 C_1-C_4 -烷基,

[0335] R^{10} 选自氢、-OH和 C_1-C_4 -烷基,

[0336] R^{11} 是氢,

[0337] R^{12} 和 R^{13} 独立地选自

[0338] 氢、-NH(-C(O)- C_1-C_4 -烷基)、 C_1-C_4 -烷氧基;

[0339] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-NH-C(O)- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、和(C_1-C_4 -烷氧基)₂P(=O)-;

[0340] 杂环基- C_1-C_4 -烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、-OH、氧代、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基和 C_1-C_4 -烷氧基;

[0341] 苯基和苯并- C_5-C_6 -环烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基;和

[0342] 选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氧代、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基,

[0343] R^{14} 选自

[0344] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基和 C_3-C_6 -环烷基;和

[0345] 4-至10-元杂环烷基,

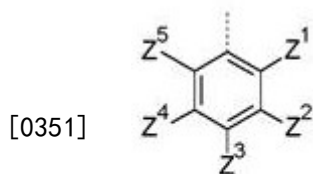
[0346] R^{15} 选自

[0347] 氢;

[0348] C_1-C_4 -烷基,其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:-OH和-COOH;和

[0349] 6-元杂芳基,

[0350] Q 是式(Q1)的取代的苯基环



(Q1)

[0352] 其中:

[0353] Z^1 和 Z^5 独立地选自氢、卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基,

[0354] Z^2 和 Z^4 独立地选自氢、卤素、氰基、-OH、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-

C_4 -卤代烷氧基、-S-(C_1 - C_4 -烷基)和4-至6-元杂环烷基,和

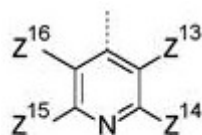
[0355] Z^3 选自氢、卤素、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基和-N(C_1 - C_4 -烷基)₂,或

[0356] Z^1 和 Z^2 与它们所连接的碳原子一起形成5-元杂环烷基或5-元杂芳基,其各自可任选地被一个或两个选自下述的取代基取代:甲基、氟和氧代,

[0357] Z^3 和 Z^5 是氢,和

[0358] Z^4 选自氢和 C_1 - C_4 -烷氧基-C(O)-,或

[0359] Q 是式(Q4)的吡啶环



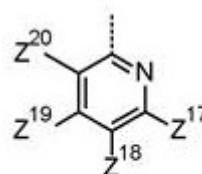
[0360]

(Q4)

[0361] 其中:

[0362] Z^{13} 、 Z^{14} 、 Z^{15} 和 Z^{16} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -羟基烷基、 NH_2 、-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、-NH-CO- C_1 - C_4 -烷基,和选自下述的单环杂环:4-至7-元杂环烷基或具有至少一个氮原子的5-元杂芳基,所述杂芳基环通过该氮原子与所述吡啶环相连,其各自任选地被1、2或3个独立地选自下述的取代基取代:卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_3 - C_6 -环烷基、- NH_2 、-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、-S- C_1 - C_4 -烷基、-S(O)- C_1 - C_4 -烷基、- SO_2 - C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-S(O)-(C_1 - C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-SO₂-(C_1 - C_4 -卤代烷基),或

[0363] Q 是式(Q5)的吡啶环



[0364]

(Q5)

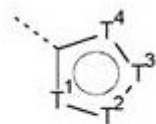
[0365] 其中:

[0366] Z^{17} 、 Z^{18} 、和 Z^{19} 是氢,和

[0367] Z^{20} 是卤素,或

[0368] Q 是式(Q6)的5-元芳族杂环

[0369]



(Q6)

[0370] 其中:

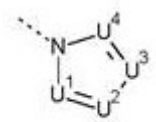
[0371] $T^1 - T^4$ 独立地选自N、O、S、C- Z^{21} 和N- Z^{22} , 其中 $T^1 - T^4$ 中不超过一个是O, $T^1 - T^4$ 中不超过一个是S, $T^1 - T^4$ 中不超过一个是N- Z^{22} , 并且其中

[0372] 每个 Z^{21} 独立地选自氢、卤素、氰基、 $C_1 - C_4$ -烷基、具有1至5个卤素原子的 $C_1 - C_4$ -卤代烷基、 $C_1 - C_4$ -烷氧基, 和

[0373] 每个 Z^{22} 独立地选自氢、 $C_1 - C_4$ -烷基、具有1至5个卤素原子的 $C_1 - C_4$ -卤代烷基、 $C_1 - C_4$ -烷基- $C_3 - C_6$ -环烷基、 $C_1 - C_4$ -烷氧基- $C_1 - C_4$ -烷基, 或

[0374] Q 是式(Q7)的5-元芳族杂环

[0375]



(Q7)

[0376] 其中:

[0377] $U^1 - U^4$ 独立地选自N和C- Z^{23} , 其中 $U^1 - U^4$ 中不超过三个是N, 并且其中

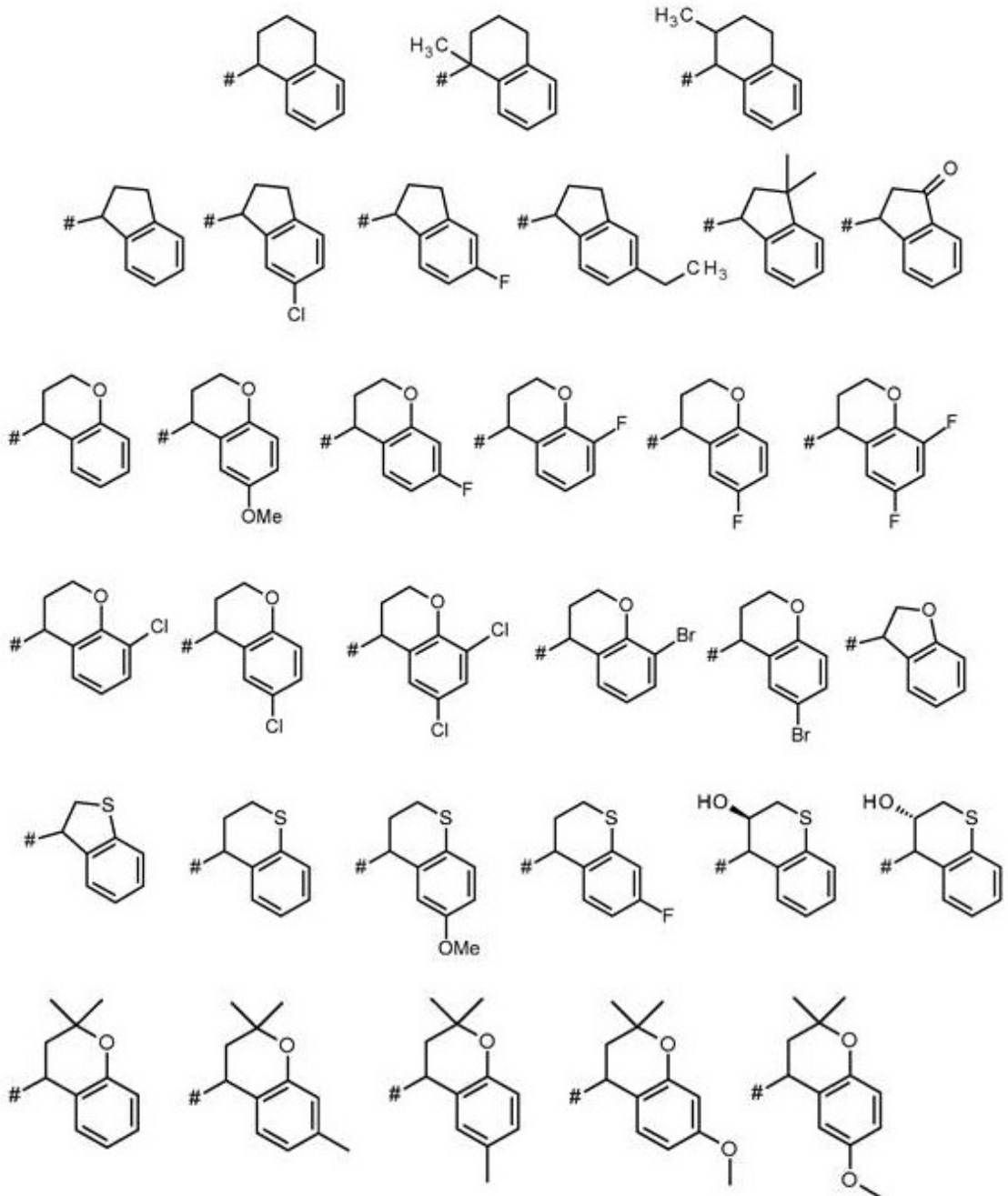
[0378] 每个 Z^{23} 独立地选自氢、卤素、氰基、 $C_1 - C_4$ -烷基、具有1至5个卤素原子的 $C_1 - C_4$ -卤代烷基、 $C_1 - C_4$ -烷氧基,

[0379] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐, 以及它们的混合物。

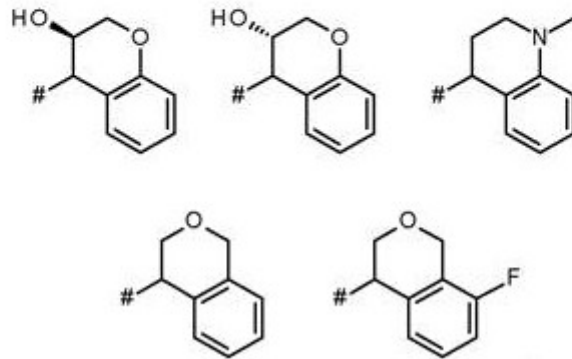
[0380] 根据第一方面的第五实施方案, 本发明涵盖上述通式(I)的化合物, 其中:

[0381] A 选自

[0382]



[0383]



[0384] R¹ 是氢或甲基,

[0385] R² 选自

[0386] 氢、氯、碘、-C(O)-N(CH₃)₂,

[0387] -NR¹²R¹³;

[0388] -OR¹⁴;

[0389] -SR¹⁵、-S(O)R¹⁵、-SO₂R¹⁵;

[0390] 甲基、乙基、丙基、异丙基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、乙烯基、丙烯基、环戊烯基、环己烯基,其各自任选地被1或2个独立地选自下述的取代基取代:-OH、氰基、乙氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、甲氧基、NH₂、N(CH₃)₂、N(CH₃)-C(O)CH₃;和

[0391] 选自以下的单环或双环杂环:氮杂环丁烷、氧杂环丁烷、吡咯烷、四氢呋喃、吡啶啉、咪唑啉、1,2,4-三唑啉、哌啶、哌嗪、四氢吡喃、四氢吡啶、二氢-2H-吡喃、1,2-噁唑啉、1,2-噁嗪、吗啉、硫代吗啉、3,4-二氢异喹啉、2,3-二氢-吲哚、1,3-二氢-异吲哚、3,9-二氧杂-7-氮杂双环[3.3.1]壬烷、6-氧杂-3-氮杂双环[3.1.1]庚烷、8-氧杂-3-氮杂双环[3.2.1]辛烷、噻吩、咪唑、吡唑、1,2,4-三唑、1,2,3-三唑、1,2,3,4-四唑、吡啶、二氢吡啶、嘧啶、四氢嘧啶、4-氧杂-7-氮杂螺[2.5]辛烷,其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代:氟、氯、氰基、-OH、氧代、-COOH、甲氧基-C(O)-、乙氧基-C(O)-、叔丁氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、甲基、甲基-C(O)-、二氟甲基、三氟甲基、羟基甲基-、甲氧基甲基-、-NH₂、-NMe₂、吡咯烷,

[0392] R³ 是氢或甲基,

[0393] R⁴ 选自氢、氟、氯、-OH、氰基、甲基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基和NH₂,

[0394] R⁵ 选自氢、氟、氯、-OH、氰基、甲基、甲氧基和三氟甲基,

[0395] R⁶ 选自氢、氟、氯、-OH、氰基、甲基和甲氧基,

[0396] R¹² 和R¹³ 独立地选自

[0397] 氢、-NH(-C(O)-甲基)、甲氧基;

[0398] 甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、环丙基、环丁基、苄基、1-苯基乙基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:氟、-OH、-COOH、甲氧基-C(O)-、乙氧基-C(O)-、叔丁氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NMe₂、-NH-C(O)-甲基、甲基、甲氧基、环丙基、-NH₂、NMe₂、S-甲基、S(O)-甲基、SO₂-甲基、和(EtO)₂P(=O)-;

[0399] 杂环基-甲基、杂环基-乙基,其中所述杂环基取代基选自氧杂环丁烷、四氢呋喃、四氢吡喃、吡咯烷、吗啉、吡唑、咪唑、1,2,4-噁二唑、吡啶,其各自任选地被1个独立地选自以下的取代基取代:氟、氯、-OH、氧代和甲基;

[0400] 苯基;

[0401] 2,3-二氢-1H-茛,和

[0402] 选自以下的单环或双环杂环:氧杂环丁烷、硫杂环丁烷、吡咯烷、吗啉、四氢吡喃、吡啶和吡唑,其各自任选地被1或2个独立地选自下述的取代基取代:氟、氯、-OH、氧代、甲基;

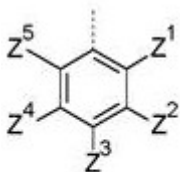
[0403] R¹⁴ 选自

[0404] 甲基、乙基、异丙基、丁基、环戊基、苄基,其各自任选地被1或2个独立地选自下述的取代基取代:氟、-OH、甲基、甲氧基和环戊基;和

[0405] 选自以下的单环或双环杂环:吡咯烷和四氢吡喃,

[0406] R¹⁵ 选自

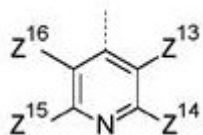
- [0407] 甲基和乙基,其各自任选地被1个独立地选自以下的取代基取代:-OH和-COOH;和
 [0408] 吡啶,
 [0409] Q 是式(Q1)的取代的苯基环



[0410]

(Q1)

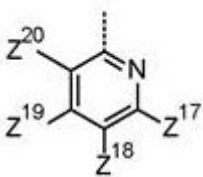
- [0411] 其中:
 [0412] Z^1 和 Z^5 独立地选自氢、氟、氯、甲基、三氟甲基和甲氧基,
 [0413] Z^2 和 Z^4 独立地选自氢、氟、氯、-OH、氰基、甲基、乙基、叔丁基、-NHMe、-NMe₂、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、-SMe和吗啉基,和
 [0414] Z^3 独立地选自氢、氟、氯、甲基、甲氧基、二氟甲氧基和-NMe₂,或
 [0415] Q 是式(Q4)的吡啶环



[0416]

(Q4)

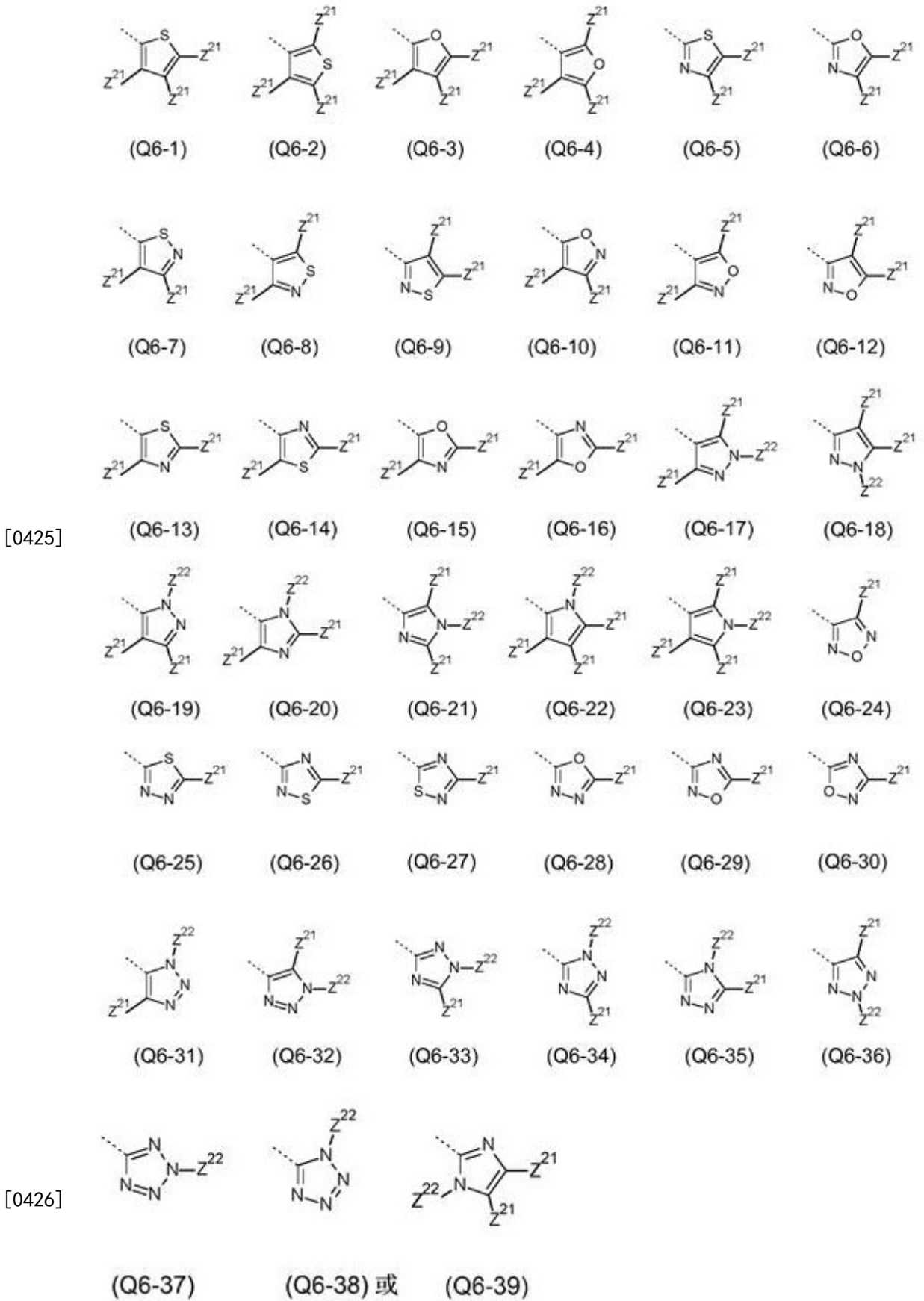
- [0417] 其中:
 [0418] Z^{13} 、 Z^{14} 、 Z^{15} 和 Z^{16} 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、甲氧基、乙氧基、异丙氧基、羟甲基、NH₂、-NHMe -NMe₂、-NH-C(O)-Me、吗啉基,或
 [0419] Q 是式(Q5)的吡啶环



[0420]

(Q5)

- [0421] 其中:
 [0422] Z^{17} 、 Z^{18} 、和 Z^{19} 是氢,和
 [0423] Z^{20} 是氟、氯,或
 [0424] Q 选自

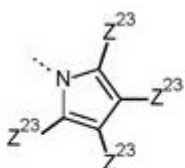


[0427] 其中：

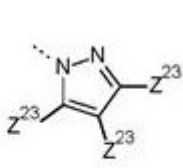
[0428] 每个Z²¹ 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基 和

[0429] Z^{22} 是氢、甲基,或

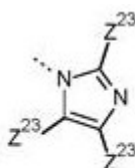
[0430] Q 选自



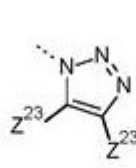
(Q7-1)



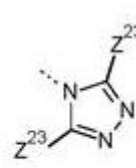
(Q7-2)



(Q7-3)

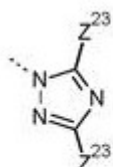


(Q7-4)

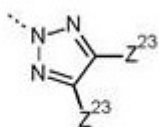


(Q7-5)

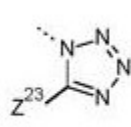
[0431]



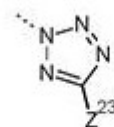
(Q7-6)



(Q7-7)



(Q7-8)

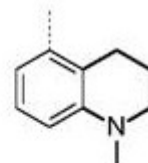
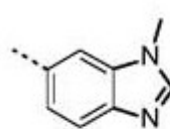
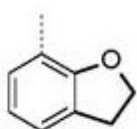
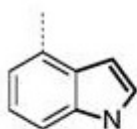


(Q7-9)

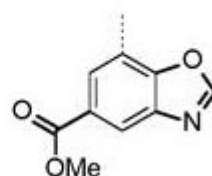
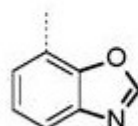
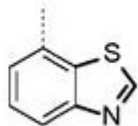
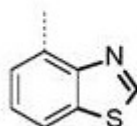
[0432] 其中:

[0433] 每个 Z^{23} 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基,或

[0434] Q 选自



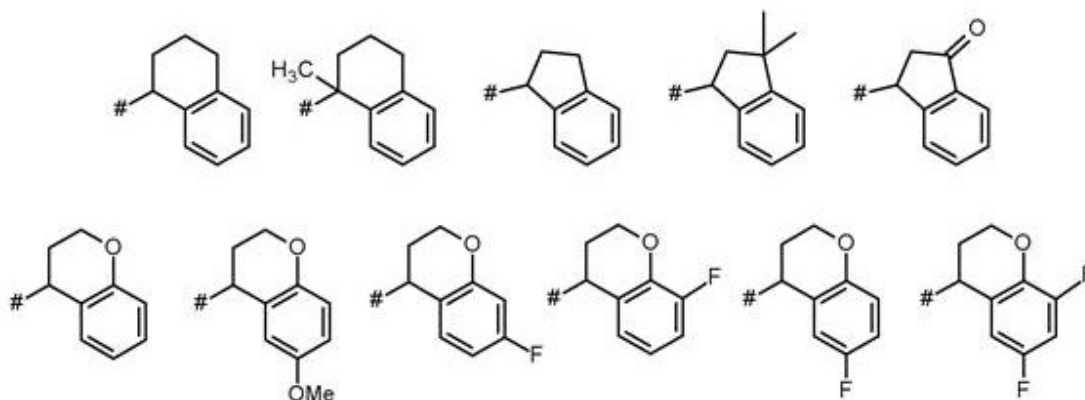
[0435]



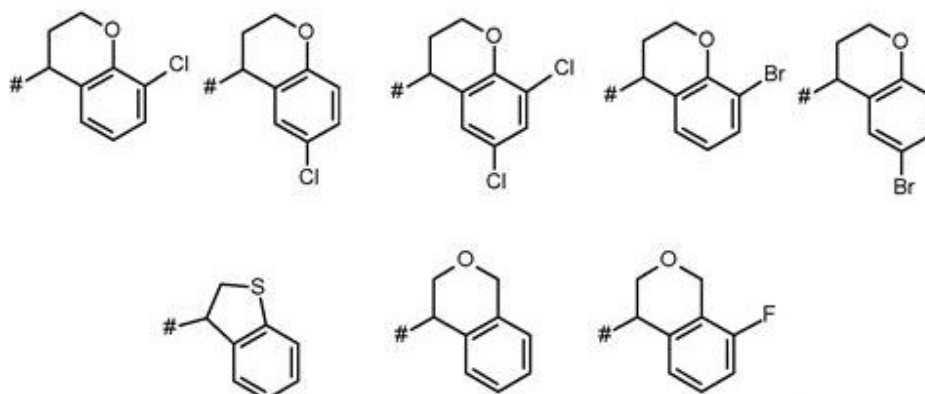
[0436] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0437] 根据第一方面的第六实施方案,本发明涵盖上述通式(I)的化合物,其中:

[0438] A 选自



[0439]

[0440] R^1 是氢或甲基,[0441] R^2 选自[0442] 氯、碘、 $-C(O)-N(CH_3)_2$,[0443] $-NR^{12}R^{13}$;[0444] $-OR^{14}$;[0445] $-SR^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-SO_2R^{15}$;

[0446] 甲基、乙基、丙基、异丙基、环丙基、环丁基、环戊基、乙烯基、丙烯基,其各自任选地被1或2个独立地选自下述的取代基取代: $-OH$ 、氰基、乙氧基 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、甲氧基、 NH_2 、 $N(CH_3)_2$ 、 $N(CH_3)C(O)CH_3$;和

[0447] 选自以下的单环或双环杂环:氮杂环丁烷、氧杂环丁烷、吡咯烷、四氢呋喃、吡啶烷、咪唑烷、1,2,4-三唑烷、哌啶、哌嗪、四氢吡喃、二氢-2H-吡喃、1,2-噁唑烷、吗啉、硫代吗啉、3,4-二氢异喹啉、2,3-二氢-吲哚(indole)、1,3-二氢-异吲哚、3,9-二氧杂-7-氮杂双环[3.3.1]壬烷、6-氧杂-3-氮杂双环[3.1.1]庚烷、8-氧杂-3-氮杂双环[3.2.1]辛烷、噻吩、咪唑、吡啶、1,2,3-三唑、1,2,3,4-四唑、吡啶、二氢吡啶、嘧啶、四氢嘧啶,其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代:氟、 $-OH$ 、氧代、 $-COOH$ 、甲氧基 $-C(O)-$ 、乙氧基 $-C(O)-$ 、叔丁氧基 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、甲基、甲基 $-C(O)-$ 、二氟甲基、三氟甲基、羟基甲基、甲氧基甲基、 $-NH_2$ 、 $-NMe_2$ 、吡咯烷,

[0448] R^3 是氢或甲基,[0449] R^4 选自氢、氯、氟、甲基、甲氧基和三氟甲基,[0450] R^5 选自氢、氯、氟、 $-OH$ 、氰基、甲基、三氟甲氧基和 NH_2 ,

[0451] R^6 选自氢、氟、氯、-OH、氰基、甲基和甲氧基，

[0452] R^{12} 和 R^{13} 独立地选自

[0453] 氢、-NH(-C(O)-甲基)、甲氧基；

[0454] 甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、环丙基、环丁基、苄基、1-苯基乙基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：氟、-OH、-COOH、甲氧基-C(O)-、乙氧基-C(O)-、叔丁氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NMe₂、-NH-C(O)-甲基、甲基、甲氧基、环丙基、-NH₂、-NMe₂、SO₂-甲基和 (EtO)₂P(=O)-；

[0455] 杂环基-甲基、杂环基-乙基，其中所述杂环基取代基选自氧杂环丁烷、四氢呋喃、四氢吡喃、吡咯烷、吡啶、咪唑、1,2,4-噁二唑、吗啉、吡啶，其各自任选地被1个独立地选自以下的取代基取代：氧代和甲基；

[0456] 苯基；

[0457] 2,3-二氢-1H-茚，和

[0458] 选自以下的单环或双环杂环：氧杂环丁烷、吗啉、四氢吡喃、吡啶和吡啶；

[0459] R^{14} 选自

[0460] 甲基、乙基、异丙基、丁基、环戊基、苄基，其各自任选地被1或2个独立地选自下述的取代基取代：氟、-OH、甲基、甲氧基和环戊基；和

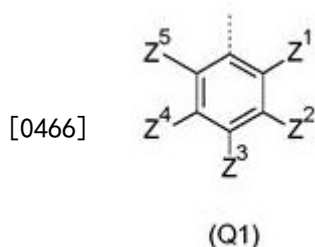
[0461] 选自以下的单环或双环杂环：吡咯烷和四氢吡喃，

[0462] R^{15} 选自

[0463] 甲基和乙基，其各自任选地被1个独立地选自以下的取代基取代：-OH和-COOH；和

[0464] 吡啶，

[0465] Q 是式 (Q1) 的取代的苯基环



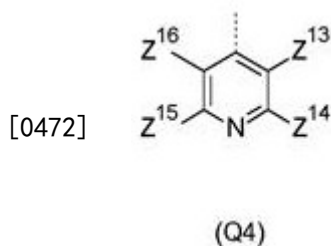
[0467] 其中：

[0468] Z^1 和 Z^5 独立地选自氢、氟、氯、甲基、甲氧基和三氟甲基，

[0469] Z^2 和 Z^4 独立地选自氢、氟、氯、-OH、氰基、甲基、乙基、叔丁基、-NHMe、-NMe₂、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、-SMe和吗啉基，和

[0470] Z^3 独立地选自氢、氟、氯、甲基、甲氧基、二氟甲氧基和-NMe₂，或

[0471] Q 是式 (Q4) 的吡啶环

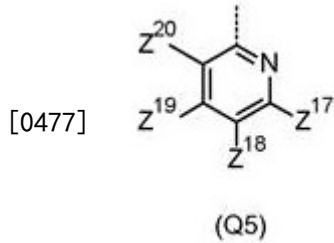


[0473] 其中:

[0474] Z^{14} 和 Z^{15} 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、甲氧基、乙氧基、异丙氧基、羟基甲基、 NH_2 、吗啉基和

[0475] Z^{13} 和 Z^{16} 独立地选自氢、氟、氯、甲基、甲氧基,或

[0476] Q 是式(Q5)的吡啶环

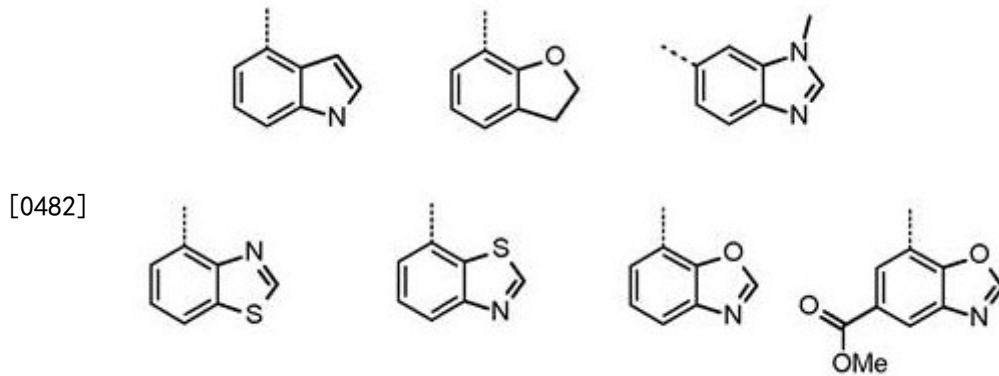


[0478] 其中:

[0479] Z^{17} 、 Z^{18} 、和 Z^{19} 是氢,和

[0480] Z^{20} 是氟,或

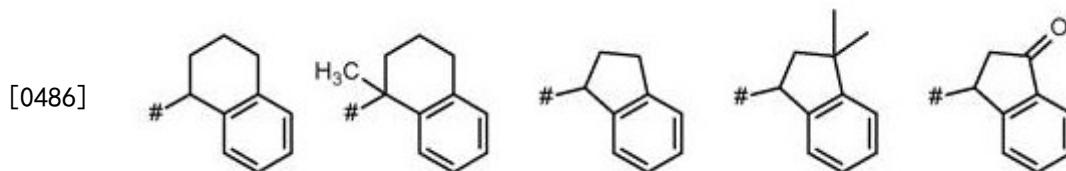
[0481] Q 选自

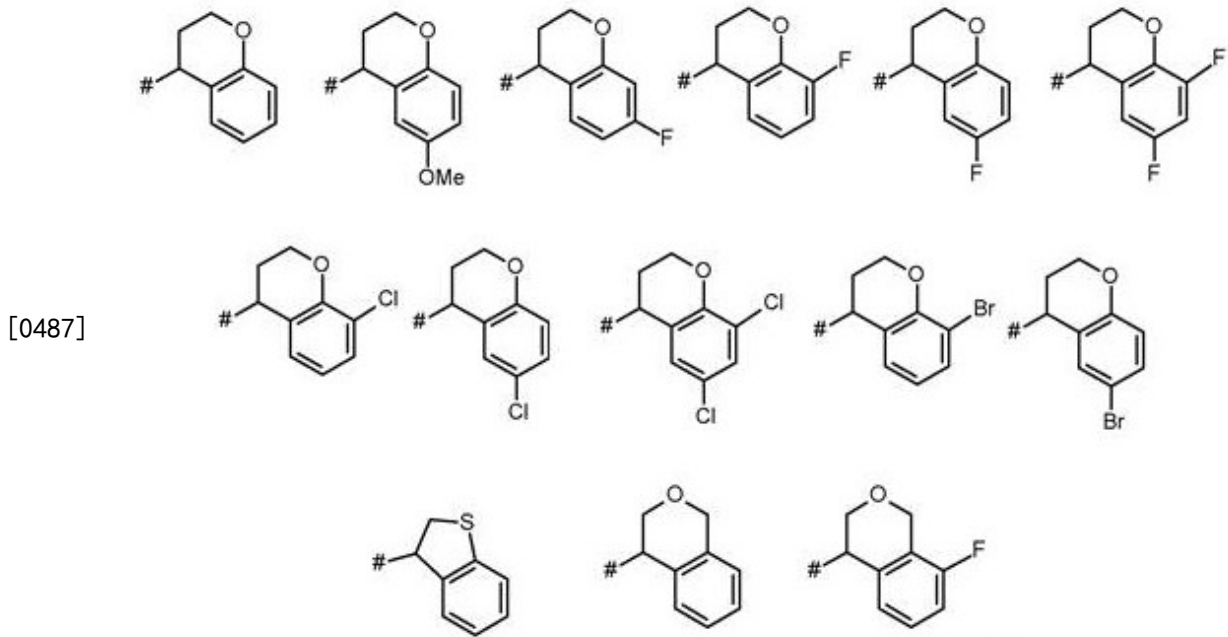


[0483] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0484] 根据第一方面的第七实施方案,本发明涵盖上述通式(I)的化合物,其中:

[0485] A 选自





[0488] R^1 是氢或甲基,

[0489] R^2 选自氢、(1S)-2,3-二氢-1H-茛-1-基氨基、(2,3-二氟苄基)氧基、(2-乙酰氨基乙基)氨基、(2-氨基-2-氧代乙基)氨基、(2-氨基乙基)氨基、(2-羧基乙基)硫烷基、(2-乙氧基-2-氧代乙基)(甲基)氨基、(2-羟基乙基)(甲基)氨基、(2-羟基乙基)氨基、羟基甲基、甲氧基甲基、2-羟基乙基、(2-羟基乙基)氧基、(2-羟基乙基)硫烷基、(2-甲氧基-2-氧代乙基)氨基、(3-甲氧基-3-氧代丙基)-甲基氨基、(2-甲氧基乙基)(甲基)氨基、(2-甲氧基乙基)氨基、(2-甲氧基乙基)氧基、(2R)-2-(羟基甲基)吡咯烷-1-基、(2R)-2-(甲氧基羰基)吡咯烷-1-基、(2R)-2-(甲氧基甲基)吡咯烷-1-基、(2R)-2-(叔丁氧基羰基)吡咯烷-1-基、(2R)-2-甲酸根合吡咯烷-1-基、(2R)-2-羧基吡咯烷-1-基、(2R,6S)-2,6-二甲基吗啉-4-基、2-(三氟甲基)吗啉-4-基、(2rac)-2-羧基吡咯烷-1-基、(2S)-2-(乙氧基羰基)吡咯烷-1-基、(2S)-2-(羟基甲基)吡咯烷-1-基、(2S)-2-(甲氧基羰基)吡咯烷-1-基、(2S)-2-(甲氧基甲基)吡咯烷-1-基、(2S)-2-(叔丁氧基羰基)吡咯烷-1-基、(2S)-2-氨基甲酰基吡咯烷-1-基、(2S)-2-羧基吡咯烷-1-基、(2S)-2-甲基-2,3-二氢-1H-吡啶-1-基、(2S)-2-甲基吗啉-4-基、(2-叔丁氧基-2-氧代乙基)(甲基)氨基、(2-叔丁氧基-2-氧代乙基)氨基、2,2-二氟乙基(甲基)氨基、(3,3,3-三氟丙基)氨基、(3,3-二甲基丁基)氧基、(3-氨基-3-氧代丙基)(甲基)氨基、(3-氨基-3-氧代丙基)氨基、(3-氟苄基)氧基、(3-甲氧基-3-甲基丁基)氧基、(3-甲氧基苄基)氧基、(3R)-3-(羟基甲基)吡咯烷-1-基、(3R)-3-(甲氧基羰基)吡咯烷-1-基、(3R)-3-氨基吡咯烷-1-基、(3R)-3-羧基吡咯烷-1-基、(3R)-3-羟基吡咯烷-1-基、(3R)-吡咯烷-3-基氧基、(3rac,4rac)-3-氨基-4-氟吡咯烷-1-基、(3S)-3-(二甲基氨基)吡咯烷-1-基、(3S)-3-(羟基甲基)吡咯烷-1-基、(3S)-3-(甲氧基羰基)吡咯烷-1-基、(3S)-3-羟基吡咯烷-1-基、(甲酸根合甲基)氨基、(羧基甲基)(甲基)氨基、(羧基乙基)氨基、(环戊基甲基)氧基、(环丙基甲基)(甲基)氨基、(吡啶-2-基甲基)氨基、(rac)-3-羟基吡咯烷-1-基、[(1R,3S)-3-氨基-2,2-二甲基环丙基]氨基、[(2R)-1-羟基丁-2-基]氨基、[(2S)-1-氨基-1-氧代丙-2-基]氨基、[(5-甲基-1,2,4-噁二唑-3-基)甲基]氨基、[(二乙氧基磷酰基)甲基](甲

基)氨基、[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]氨基、2-(1H-咪唑-1-基)乙基氨基、2-(1H-咪唑-1-基)乙基-甲基氨基、[2-(环丙基氨基)乙基]氨基、[2-(二甲基氨基)乙基]氨基、[2-(吡咯烷-1-基)乙基]氨基、[3-(二甲基氨基)-3-氧代丙基]氨基、1,1-二氧化硫代吗啉-4-基、1,2-噁唑烷-2-基、1,3-二氢-2H-异吡啶-2-基、1-氰基-2-乙氧基-2-氧代乙基、1H-1,2,3-三唑-1-基、1H-咪唑-1-基、1H-吡唑-1-基、1H-吡唑-4-基、1H-吡唑-4-基氨基、2,2-二甲基吗啉-4-基、2,2-二甲基吡咯烷-1-基、2,4-二甲基-3,5-二氧代-1,2,4-三唑烷-1-基、2-乙酰肼基、2-氨基-2-氧代乙基、2H-1,2,3-三唑-2-基、1H-四唑-5-基、3-(吡咯烷-1-基)氮杂环丁烷-1-基、3,3-二氟氮杂环丁烷-1-基、3,3-二氟吡咯烷-1-基、3,4-二氢异喹啉-2(1H)-基、3,9-二氧杂-7-氮杂双环[3.3.1]壬-7-基、3-氟氮杂环丁烷-1-基、3-羟基氮杂环丁烷-1-基、3-甲基氮杂环丁烷-1-基、3-氧代吡唑烷-1-基、1-(二氟甲基)-1H-吡唑-4-基、4-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基、1-甲基-哌啶-4-基、4-氟哌啶-1-基、4,4-二氟哌啶-1-基、4-乙酰基哌啶-1-基、4-氧代咪唑烷-1-基、6-氧杂-3-氮杂双环[3.1.1]庚-3-基、8-氧杂-3-氮杂双环[3.2.1]辛-3-基、氨基、苯胺基、氮杂环丁烷-1-基、苄基(甲基)氨基、双(2-甲氧基乙基)氨基、氯、碘、氰基甲基、环丁基(甲基)氨基、环戊基氧基、环丙基、环丁基、环戊基、环丙基(乙基)氨基、环丙基(甲基)氨基、环丙基氨基、二乙基氨基、二甲基氨基、二甲基氨基羰基、氨基甲基、2-氨基乙基、(二甲基氨基)甲基、2-(二甲基氨基)乙基、[乙酰基(甲基)氨基]甲基、乙烯基、乙基、乙基(2-甲氧基乙基)氨基、乙基氨基、乙基氧基、乙基硫烷基、乙基亚磺酰基、乙基磺酰基、乙基(甲基)氨基、异丁基(甲基)氨基、异丙基(甲基)氨基、异丙基、异丙基氧基、甲氧基(甲基)氨基、甲氧基氨基、甲基、甲基(2-甲基磺酰基乙基)氨基、甲基-氧杂环戊烷-3-基]甲基]氨基、甲基(氧杂环己烷-4-基甲基)氨基、甲基(1-苯基乙基)氨基、甲基(2,2,2-三氟乙基)氨基、氧杂环丁烷-3-基甲基氨基、甲基(氧杂环丁烷-3-基)氨基、甲基(苯基)氨基、甲基[2-(2-氧代吡咯烷-1-基)乙基]氨基、甲基[2-(吗啉-4-基)乙基]氨基、甲基氨基、甲基氧基、甲基硫烷基、吗啉-4-基、吗啉-4-基氨基、次氮甲基、丙-1-烯-2-基、丙基、丙基氨基、吡啶-4-基、吡啶-2-基硫烷基、吡啶-4-基氨基、吡咯烷-1-基、吡咯烷-3-基、氧杂环丁烷-3-基、四氢呋喃-3-基、3,6-二氢-2H-吡喃-4-基、四氢吡喃-4-基、四氢-2H-吡喃-4-基氨基、四氢-2H-吡喃-4-基氧基、2-氨基嘧啶-5-基、1,3-二甲基-2,4-二氧代-1,2,3,4-四氢嘧啶-5-基、3-氟-2-氧代-1,2-二氢吡啶-5-基、2-氧代-1,2-二氢吡啶-5-基、3-噻吩基和硫代吗啉-4-基,

[0490] R^3 是氢或甲基,

[0491] R^4 选自氢、氯、氟、-OH、氰基、甲基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基和 NH_2 ,

[0492] R^5 选自氢、氯、氟、-OH、氰基、甲基、甲氧基和三氟甲基,

[0493] R^6 选自氢、氟、氯、-OH、氰基、甲基和甲氧基,

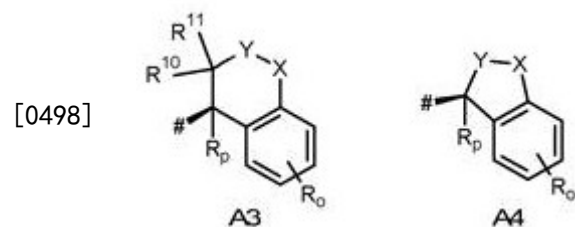
[0494] Q 选自苯基、1,3-苯并噁唑-4-基、1,3-苯并噁唑-7-基、1,3-苯并噁唑-7-基、1H-吡啶-4-基、1-甲基-1H-苯并咪唑-6-基、2,5-双(三氟甲基)苯基、2,3,4-三氟苯基、2,3,5-三氟苯基、2,3,6-三氟苯基、2,3-二氟苯基、2,3-二氟-5-氰基苯基、2,3-二氟-5-羟基苯基、2,3-二氢-1-苯并呋喃-7-基、2,3-二氟苯基、2,4,5-三氟苯基、2,4,6-三氟-3-甲氧基苯基、2,4-二氟-3-羟基苯基、2,4-二氟-3-甲氧基苯基、2,5-二氟苯基、2-氯-5-氰基苯基、2-氯-5-甲基苯基、2,5-二氟-4-甲氧基苯基、2,6-二氟苯基、2-氯-6-甲基吡啶-4-基、3-甲基吡啶-4-基、2,6-二甲基吡啶-4-基、2-氯-3-氟苯基、2-氯-4-(二甲基氨基)

苯基、2-氯-4-氟苯基、2-氯-5-氟苯基、2-氯-6-氟苯基、2-氯苯基、2-氯吡啶-4-基、3-氯吡啶-4-基、2,3-二氯吡啶-4-基、2,5-二氯吡啶-4-基、2,6-二氯吡啶-4-基、3,5-二氯吡啶-4-基、2,6-二氟吡啶-4-基、3,5-二氟吡啶-4-基、2-氯-3-氟吡啶-4-基、2-氰基吡啶-4-基、3-氯-2-甲氧基吡啶-4-基、5-氯-2-甲氧基吡啶-4-基、5-氟-2-甲氧基吡啶-4-基、5-氟-2-异丙基氧基吡啶-4-基、2,3-二甲氧基吡啶-4-基、2,6-二甲氧基吡啶-4-基、2-氟-5-甲基苯基、3-氟-5-甲基苯基、2-氟-3-(三氟甲氧基)苯基、2-氟-3-(三氟甲基)苯基、5-氟-2-(三氟甲基)苯基、3-氰基-5-甲基苯基、2-氟吡啶-4-基、2-乙氧基-5-氟吡啶-4-基、2-(羟基甲基)吡啶-4-基、2-甲基吡啶-4-基、2-甲氧基吡啶-4-基、3-甲氧基吡啶-4-基、2-氨基吡啶-4-基、2-吗啉-4-基吡啶-4-基、3-(二甲基氨基)-2,4-二氟苯基、3-(二甲基氨基)苯基、3-(甲基氨基)苯基、3-(三氟甲基)苯基、3-(三氟甲氧基)苯基、3,4,5-三氟苯基、3,4-二氯-5-(二甲基氨基)苯基、3,4-二氯苯基、3,4-二氟-2-甲氧基苯基、3,4-二氟苯基、3,5-二氯-4-(二甲基氨基)苯基、3,5-二氯-4-氟苯基、3,5-二氯苯基、3,5-二氟苯基、4-(二氟甲氧基)-3,5-二氟苯基、2,5-二甲基苯基、3,5-二甲基苯基、3-叔丁基-5-甲基苯基、5-叔丁基-2-氯-3-甲基苯基、3-氯-2-氟-5-甲基苯基、3-氯-2-氟苯基、3-氯-2-甲基苯基、3-氯-4-(二甲基氨基)-5-氟苯基、3-氯-4-(二甲基氨基)苯基、3-氯-4-氟苯基、3-氯-4-甲基苯基、3-氯-5-(二甲基氨基)苯基、3-氯-5-(甲基硫烷基)苯基、3-氯-5-(吗啉-4-基)苯基、2-氯-3-(三氟甲基)苯基、2-甲基-5-(三氟甲基)苯基、3-氯-5-(三氟甲基)苯基、3-氯-5-乙基苯基、3-氯-5-氟苯基、3-氯-5-甲氧基苯基、3-氯-5-甲基苯基、3-氯苯基、3-氟-2-甲基苯基、3-氟-4-甲氧基苯基、3-氟-5-甲基苯基、3-氟吡啶-2-基、3-氟吡啶-4-基、4-氯-3-(二甲基氨基)苯基、4-氟-3-甲氧基苯基、5-(甲氧基羰基)-1,3-苯并噁唑-7-基、5-氯-2,4-二氟苯基、5-氯-2-氟-3-甲基苯基、5-氯-2-氟-4-甲基苯基、5-氯-2-氟苯基、5-氯-2-甲氧基苯基、5-氟-2-甲基苯基、5-氟-2-甲氧基苯基、5-氯-1H-咪唑-2-基、3,5-二乙基苯基、2-氯-3,5-二乙基苯基、3-氯-2-噻吩基、4-氯-2-噻吩基、5-氯-2-噻吩基、2,5-二氯-3-噻吩基、5-氟-2-噻吩基、5-氰基-2-噻吩基、5-氰基-4-甲基-2-噻吩基、5-甲基-2-噻吩基、2,5-二甲基-3-噻吩基、5-(三氟甲基)-2-噻吩基 和 2-甲基-1,3-噻唑-5-基,

[0495] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0496] 根据第一方面的第八实施方案,本发明涵盖上述通式(I)的化合物,其中:

[0497] A 是A3或A4



[0499] o 是0或1,

[0500] R 选自卤素、C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-烷氧基,

[0501] R_p 选自氢、C₁-C₄-烷基,

[0502] X 选自CR⁷R⁸、O、S、和N-R⁹,

[0503] Y 是CR⁷R⁸或O,

- [0504] R^1 是氢或 C_1-C_4 -烷基,
- [0505] R^2 选自
- [0506] 氢、卤素、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$;
- [0507] $-NR^{12}R^{13}$;
- [0508] $-OR^{14}$;
- [0509] $-SR^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-SO_2R^{15}$;
- [0510] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_2-C_4 -烯基或 C_3-C_6 -环烯基,其各自任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代:卤素、 $-OH$ 、氰基、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 和 $-C(O)-NH_2$ 、 C_1-C_4 -烷氧基、 $-NH_2$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)(C(O)-C_1-C_4-烷基)$,和
- [0511] 选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、杂螺环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代:卤素、 $-OH$ 、氧代、 $-COOH$ 、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基- $C(O)-$ 、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、羟基- C_1-C_4 -烷基-、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基-、 $-NH_2$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 和4-至10-元杂环烷基,
- [0512] R^3 是氢或 C_1-C_4 -烷基,
- [0513] R^4 选自氢、卤素、 $-OH$ 、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 NH_2 ,
- [0514] R^5 选自氢、卤素、 $-OH$ 、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基,
- [0515] R^6 选自氢、卤素、 $-OH$ 、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基,
- [0516] R^7 选自氢和 C_1-C_4 -烷基,
- [0517] R^8 选自氢和 C_1-C_4 -烷基,
- [0518] 或者 R^7 和 R^8 一起形成氧代基团($=O$),
- [0519] R^9 是 C_1-C_4 -烷基,
- [0520] R^{10} 选自氢、 $-OH$ 和 C_1-C_4 -烷基,
- [0521] R^{11} 是氢,
- [0522] R^{12} 和 R^{13} 独立地选自
- [0523] 氢、 $-NH(-C(O)-C_1-C_4-烷基)$ 、 C_1-C_4 -烷氧基;
- [0524] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、 $-OH$ 、 $-COOH$ 、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-NH-C(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 和 $(C_1-C_4-烷氧基)_2P(=O)-$;
- [0525] 杂环基- C_1-C_4 -烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、 $-OH$ 、氧代、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基和 C_1-C_4 -烷氧基;
- [0526] 苯基和苯并- C_5-C_6 -环烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基;和

[0527] 选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、-OH、氧代、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基，

[0528] R^{14} 选自

[0529] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、-OH、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基和 C_3-C_6 -环烷基；和

[0530] 4-至10-元杂环烷基，

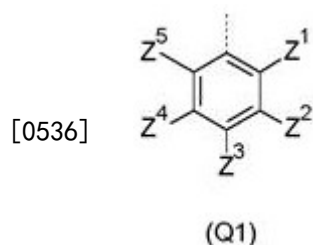
[0531] R^{15} 选自

[0532] 氢；

[0533] C_1-C_4 -烷基，其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：-OH和-COOH；和

[0534] 6-元杂芳基，

[0535] Q 是式 (Q1) 的取代的苯基环



[0537] 其中：

[0538] Z^1 和 Z^5 独立地选自氢、卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基和具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基，

[0539] Z^2 和 Z^4 独立地选自氢、卤素、氰基、-OH、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、-S-(C_1-C_4 -烷基)和4-至6-元杂环烷基，和

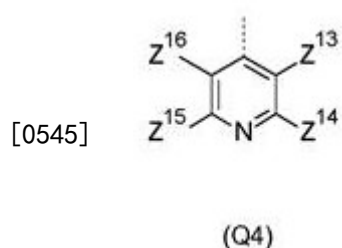
[0540] Z^3 选自氢、卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基和-N(C_1-C_4 -烷基)₂，或

[0541] Z^1 和 Z^2 与它们所连接的碳原子一起形成5元杂环烷基或5-元杂芳基，其各自可任选地被一个或两个选自下述的取代基取代：甲基、氟和氧代，

[0542] Z^3 和 Z^5 是氢，和

[0543] Z^4 选自氢和 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-，或

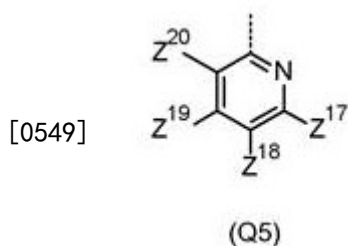
[0544] Q 是式 (Q4) 的吡啶环



[0546] 其中：

[0547] Z^{13} 、 Z^{14} 、 Z^{15} 和 Z^{16} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -羟基烷基、 NH_2 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-NH-CO-C_1-C_4-烷基$ ，和选自下述的单环杂环：4-至7-元杂环烷基或具有至少一个氮原子的5-元杂芳基，所述杂芳基环通过该氮原子与所述吡啶环相连，其各自任选地被1、2或3个独立地选自下述的取代基取代：卤素、氰基、硝基、 $-OH$ 、氧代、硫羰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_3 - C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-(C_1-C_4-卤代烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-(C_1-C_4-卤代烷基)$ 、具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-(C_1-C_4-卤代烷基)$ ，或

[0548] Q 是式 (Q5) 的吡啶环

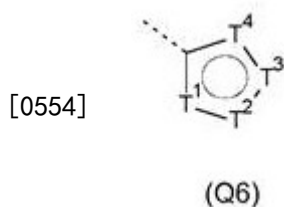


[0550] 其中：

[0551] Z^{17} 、 Z^{18} 、和 Z^{19} 是氢，和

[0552] Z^{20} 是卤素，或

[0553] Q 是式 (Q6) 的5-元芳族杂环



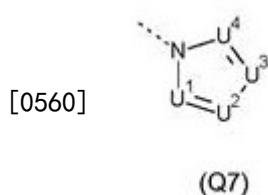
[0555] 其中：

[0556] $T^1 - T^4$ 独立地选自N、O、S、 $C-Z^{21}$ 和 $N-Z^{22}$ ，其中 $T^1 - T^4$ 中不超过一个是O， $T^1 - T^4$ 中不超过一个是S， $T^1 - T^4$ 中不超过一个是N- Z^{22} ，并且其中

[0557] 每个 Z^{21} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基，和

[0558] 每个 Z^{22} 独立地选自氢、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷基- C_3 - C_6 -环烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基，或

[0559] Q 是式 (Q7) 的5-元芳族杂环



[0561] 其中：

[0562] $U^1 - U^4$ 独立地选自N和C- Z^{23} , 其中 $U^1 - U^4$ 中不超过三个是N, 并且其中

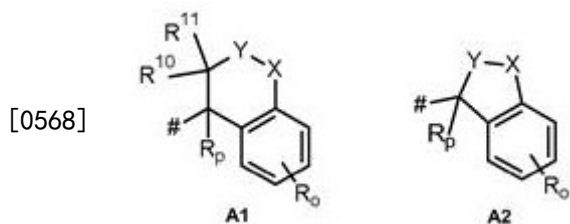
[0563] 每个 Z^{23} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基,

[0564] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐, 以及它们的混合物。

[0565] 本发明第一方面的另外的实施方案:

[0566] 在第一方面的另一实施方案中, 本发明涵盖上述式 (I) 的化合物, 其中:

[0567] A 是A1或A2,



[0569] o 是0、1或2,

[0570] R 选自卤素、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基、氰基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基,

[0571] R_p 是氢,

[0572] X、Y 独立地选自 CR^7R^8 、O、S和 $N-R^9$, 其中X和Y中的至少一个是 CR^7R^8 ,

[0573] R^7 选自氢和 C_1-C_4 -烷基,

[0574] R^8 选自氢和 C_1-C_4 -烷基,

[0575] R^9 是 C_1-C_4 -烷基,

[0576] R^{10} 选自氢、-OH、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基, 和

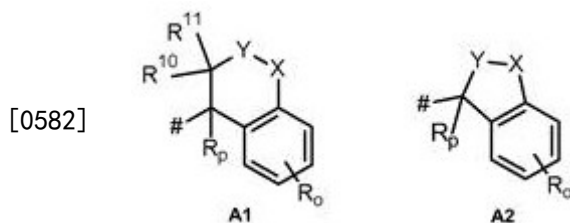
[0577] R^{11} 是氢,

[0578] 其中当Y是O、S或 $N-R^9$ 时, R^{10} 不是-OH,

[0579] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐, 以及它们的混合物。

[0580] 在第一方面的另一实施方案中, 本发明涵盖上述式 (I) 的化合物, 其中:

[0581] A 是A1或A2,



[0583] o 是0、1或2,

[0584] R 选自卤素、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基、氰基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基,

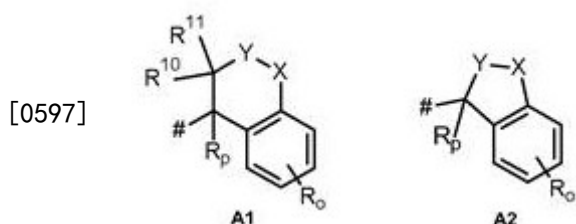
[0585] R_p 选自氢、 C_1-C_4 -烷基,

[0586] X、Y 独立地选自 CR^7R^8 、O、S和 $N-R^9$, 其中X和Y中的至少一个是 CR^7R^8 ,

- [0587] R^7 选自氢和 C_1-C_4 -烷基，
 [0588] R^8 选自氢和 C_1-C_4 -烷基，
 [0589] 或者 R^7 和 R^8 一起形成氧代基团(=O)，
 [0590] R^9 是 C_1-C_4 -烷基，
 [0591] R^{10} 选自氢、-OH、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，和
 [0592] R^{11} 是氢，
 [0593] 其中当Y是O、S或N- R^9 时， R^{10} 不是-OH，
 [0594] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐，以及它们的混合物。

[0595] 在第一方面的另一实施方案中，本发明涵盖上述式(I)的化合物，其中：

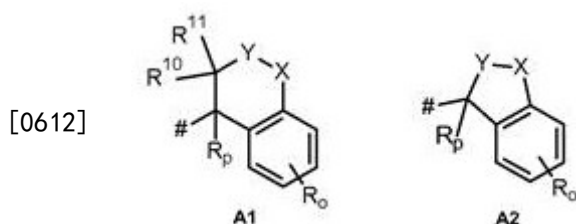
[0596] A 是A1或A2，



- [0598] o 是0、1或2，
 [0599] R 选自卤素、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基、氰基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基，
 [0600] R_p 是氢，
 [0601] X、Y 独立地选自 CR^7R^8 、O和 S，
 [0602] 其中X和Y中的至少一个是 CR^7R^8 ，
 [0603] R^7 选自氢和 C_1-C_4 -烷基，
 [0604] R^8 选自氢和 C_1-C_4 -烷基，
 [0605] 或者 R^7 和 R^8 一起形成氧代基团(=O)，
 [0606] R^{10} 选自氢、-OH、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基，和
 [0607] R^{11} 是氢，
 [0608] 其中当Y是O、S或N- R^9 时， R^{10} 不是-OH，
 [0609] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐，以及它们的混合物。

[0610] 在第一方面的另一实施方案中，本发明涵盖上述式(I)的化合物，其中：

[0611] A 是A1或A2，



[0613] o 是0或1，

[0614] R 选自卤素、C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-烷氧基，

[0615] R_p 是氢，

[0616] X 选自CR⁷R⁸、O、S和N-R⁹，

[0617] Y 是CR⁷R⁸，

[0618] R⁷ 选自氢和C₁-C₄-烷基，

[0619] R⁸ 选自氢和C₁-C₄-烷基，

[0620] R⁹ 是C₁-C₄-烷基，

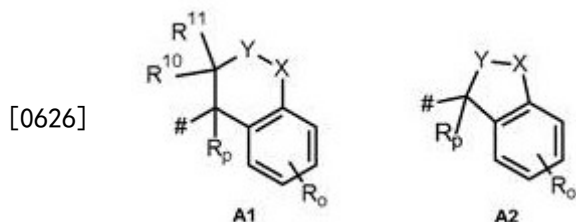
[0621] R¹⁰ 选自氢、-OH和C₁-C₄-烷基，和

[0622] R¹¹ 是氢，

[0623] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐，以及它们的混合物。

[0624] 在第一方面的另一实施方案中，本发明涵盖上述式 (I) 的化合物，其中：

[0625] A 是A1或A2，



[0627] o 是0或1，

[0628] R 选自卤素、C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-烷氧基，

[0629] R_p 选自氢、C₁-C₄-烷基，

[0630] X 选自CR⁷R⁸、O、S、和N-R⁹，

[0631] Y 是CR⁷R⁸或O，

[0632] R⁷ 选自氢和C₁-C₄-烷基，

[0633] R⁸ 选自氢和C₁-C₄-烷基，

[0634] 或者R⁷ 和R⁸ 一起形成氧代基团 (=O)，

[0635] R⁹ 是C₁-C₄-烷基，

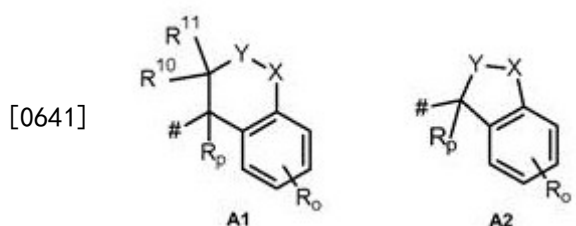
[0636] R¹⁰ 选自氢、-OH和C₁-C₄-烷基，和

[0637] R¹¹ 是氢，

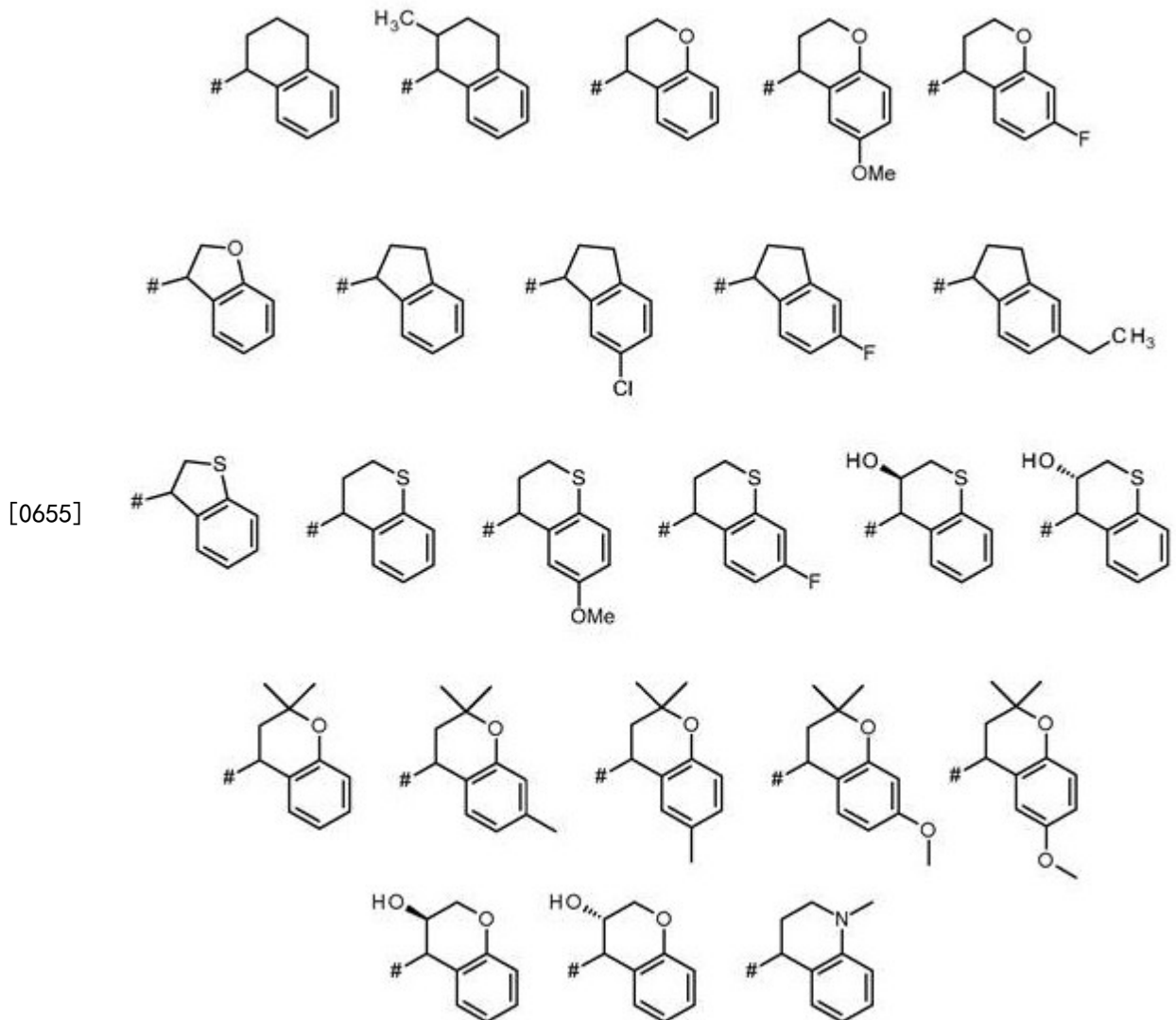
[0638] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐，以及它们的混合物。

[0639] 在第一方面的另一实施方案中，本发明涵盖上述式 (I) 的化合物，其中：

[0640] A 是A1或A2，



- [0642] o 是0或1，
 [0643] R 选自卤素、C₁-C₄-烷基和C₁-C₄-烷氧基，
 [0644] R_p 是氢，
 [0645] X 选自CR⁷R⁸、O和S和N-R⁹、
 [0646] Y 是CR⁷R⁸或O，
 [0647] R⁷ 选自氢和C₁-C₄-烷基，
 [0648] R⁸ 选自氢和C₁-C₄-烷基，
 [0649] 或者R⁷ 和R⁸ 一起形成氧代基团(=O)，
 [0650] R¹⁰ 选自氢、-OH和C₁-C₄-烷基，和
 [0651] R¹¹ 是氢，
 [0652] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐，以及它们的混合物。
 [0653] 在第一方面的另一实施方案中，本发明涵盖上述式(I)的化合物，其中：
 [0654] A 选自

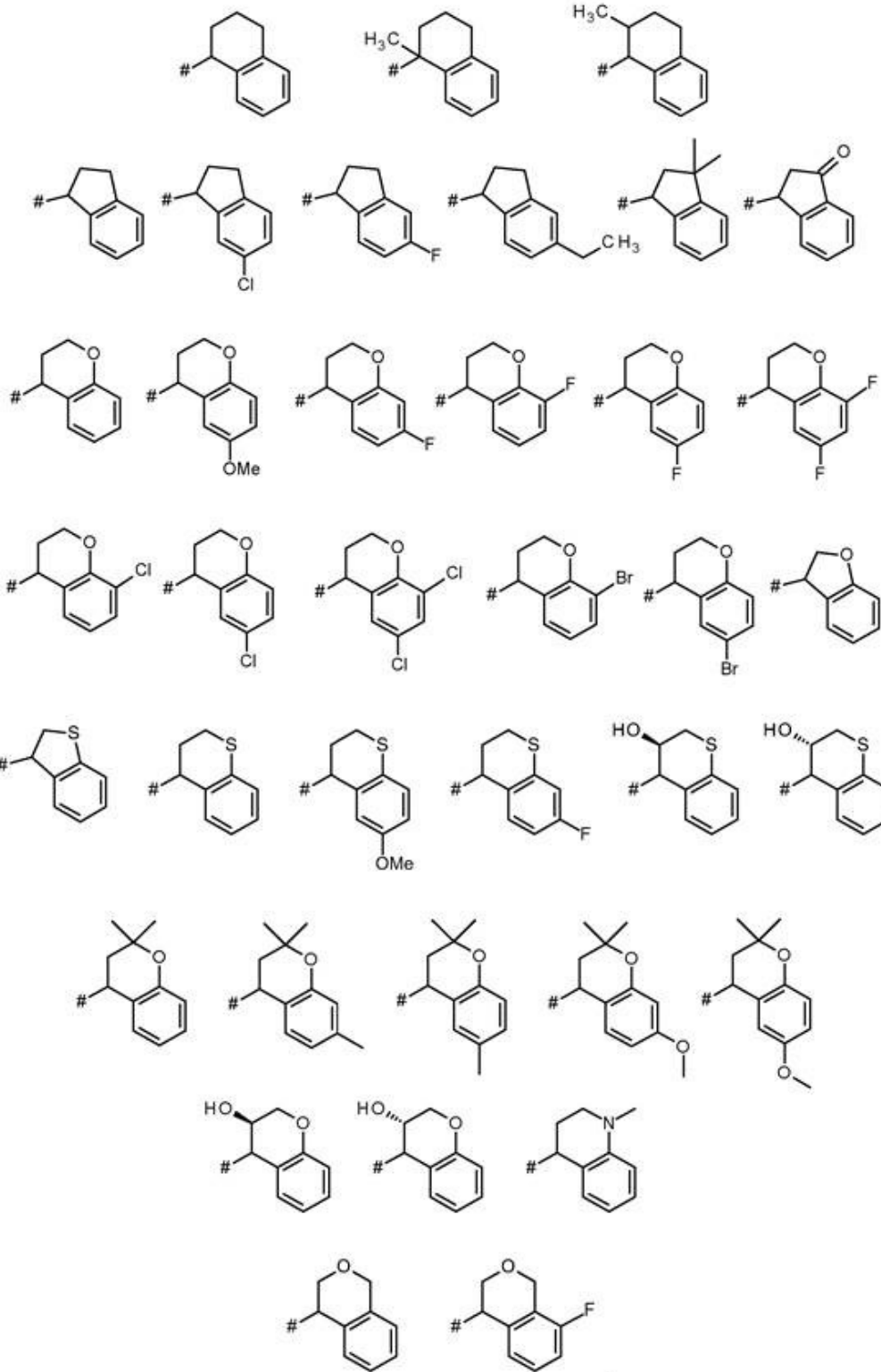


- [0656] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐，以及它们的混合

物。

[0657] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:

[0658] A 选自

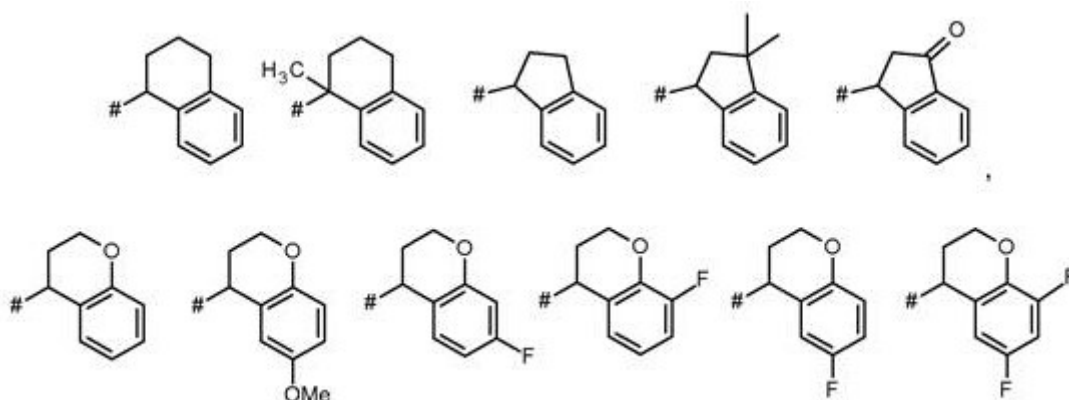


[0659]

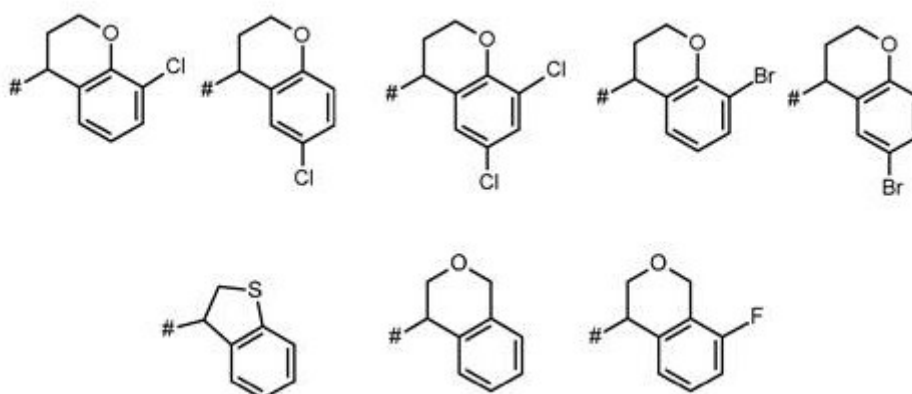
[0660] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0661] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:

[0662] A 选自



[0663]



[0664] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0665] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:

[0666] R^2 选自

[0667] 氢、卤素、氰基、 $-COOH$ 、 C_1-C_4 -烷氧基、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$;

[0668] $-NR^{12}R^{13}$;

[0669] $-OR^{14}$;

[0670] $-SR^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-SO_2R^{15}$;

[0671] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_3-C_6 -环烯基、 C_2-C_4 -炔基或苯基- C_1-C_4 -烷基,其各自任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代:卤素、 $-OH$ 、氰基、 C_1-C_4 -烷氧基、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4$ -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4$ -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4$ -卤代烷基;和

[0672] 选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、杂螺环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、 $-OH$ 、氧

代、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C_1-C_4 -烷基)、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基-C(O)-、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羟基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基-、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂和 4-至10-元杂环烷基，

[0673] R¹² 和R¹³ 独立地选自

[0674] 氢、-NH(-C(O)- C_1-C_4 -烷基)、 C_1-C_4 -烷氧基；

[0675] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、-OH、氰基、-COOH、 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NH(C_1-C_4 -烷基)、-C(O)-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-NH-C(O)- C_1-C_4 -烷基、-N(C_1-C_4 -烷基)-(-C(O)- C_1-C_4 -烷基)、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的-S- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-S(O)- C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的-SO₂- C_1-C_4 -卤代烷基和(C_1-C_4 -烷氧基)₂P(=O)-；

[0676] 杂环基- C_1-C_4 -烷基，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、-OH、氧代、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基；

[0677] 苯基、苯并- C_5-C_6 -环烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基；和

[0678] 选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、-OH、氧代、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基，

[0679] R¹⁴ 选自

[0680] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、-OH、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基；和

[0681] 杂环基- C_1-C_4 -烷基，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、-OH、氧代、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基；

[0682] R¹⁵ 选自

[0683] 氢；

[0684] C_1-C_4 -烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、-OH、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基；

[0685] 杂环基- C_1-C_4 -烷基，其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基

和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基;

[0686] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0687] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:

[0688] R^2 选自

[0689] 氢、卤素、氰基、 $-COOH$ 、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$;

[0690] $-NR^{12}R^{13}$;

[0691] $-OR^{14}$;

[0692] $-SR^{15}$ 、 $-S(O)R^{15}$ 、 $-SO_2R^{15}$;

[0693] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_3-C_6 -环烯基、 C_2-C_4 -炔基或苯基- C_1-C_4 -烷基,其各自任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代:卤素、 $-OH$ 、氰基、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-NH(C(O)-C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)(C(O)-C_1-C_4-烷基)$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4$ -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4$ -卤代烷基和具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4$ -卤代烷基;和

[0694] 选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、杂螺环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、 $-OH$ 、氧代、 $-COOH$ 、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷基- $C(O)-$ 、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羟基- C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 和4-至10-元杂环烷基,

[0695] R^{12} 和 R^{13} 独立地选自

[0696] 氢、 $-NH(-C(O)-C_1-C_4-烷基)$ 、 C_1-C_4 -烷氧基;

[0697] C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、苯基- C_1-C_4 -烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、 $-OH$ 、氰基、 $-COOH$ 、 C_1-C_4 -烷氧基- $C(O)-$ 、 $-C(O)-NH_2$ 、 $-C(O)-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-C(O)-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-NH-C(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)-(-C(O)-C_1-C_4-烷基)$ 、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、 $-NH_2$ 、 $-NH(C_1-C_4-烷基)$ 、 $-N(C_1-C_4-烷基)_2$ 、 $-S-C_1-C_4-烷基$ 、 $-S(O)-C_1-C_4-烷基$ 、 $-SO_2-C_1-C_4-烷基$ 、具有1至5个卤素原子的 $-S-C_1-C_4$ -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 $-S(O)-C_1-C_4$ -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 $-SO_2-C_1-C_4$ -卤代烷基和 $(C_1-C_4-烷氧基)_2P(=O)-$;

[0698] 杂环基- C_1-C_4 -烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、 $-OH$ 、氧代、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基;

[0699] 苯基、苯并-C₅-C₆-环烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基;和

[0700] 选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、-OH、氧代、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基,

[0701] R¹⁴ 选自

[0702] C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、苯基-C₁-C₄-烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基、C₃-C₆-环烷基;和

[0703] 杂环基-C₁-C₄-烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、-OH、氧代、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基;

[0704] R¹⁵ 选自

[0705] 氢;

[0706] C₁-C₄-烷基、苯基-C₁-C₄-烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基;

[0707] 杂环基-C₁-C₄-烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷氧基;

[0708] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0709] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:

[0710] R² 选自

[0711] 氢、卤素,

[0712] -NR¹²R¹³;

[0713] -OR¹⁴;

[0714] -SR¹⁵、-S(O)R¹⁵、-SO₂R¹⁵;

[0715] C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₂-C₄-烯基或C₃-C₆-环烯基,其各自任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-和-C(O)-NH₂;和

[0716] 选自以下的单环或双环杂环:4-至10-元杂环烷基、杂螺环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氧代、-COOH、C₁-C₄-烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、C₁-C₄-烷基、C₁-C₄-烷基-C(O)-、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、羟基-C₁-C₄-烷基-、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基-、-NH₂、-N(C₁-C₄-烷基)₂和4-至10-元杂环烷基,

- [0717] R^{12} 和 R^{13} 独立地选自
- [0718] 氢、 $-\text{NH}(-\text{C}(\text{O})-\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷氧基}$ ；
- [0719] $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_3-\text{C}_6\text{-环烷基}$ 、苯基- $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ ，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{COOH}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷氧基}$ - $\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{NH}-\text{C}(\text{O})-\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷氧基}$ 、 $\text{C}_3-\text{C}_6\text{-环烷基}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{S}-\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ 、 $-\text{S}(\text{O})-\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ 、 $-\text{SO}_2-\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ ，和 $(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷氧基})_2\text{P}(=\text{O})-$ ；
- [0720] 杂环基- $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ ，其中杂环取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、 $-\text{OH}$ 、氧代、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-卤代烷基}$ 和 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷氧基}$ ；
- [0721] 苯基和苯并- $\text{C}_5-\text{C}_6\text{-环烷基}$ ，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、氰基、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-卤代烷基}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷氧基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-卤代烷氧基}$ ；和
- [0722] 选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-\text{OH}$ 、氧代、氰基、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-卤代烷基}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷氧基}$ 、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-卤代烷氧基}$ ，
- [0723] R^{14} 选自
- [0724] $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_3-\text{C}_6\text{-环烷基}$ 、苯基- $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ ，其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-\text{OH}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷氧基}$ 和 $\text{C}_3-\text{C}_6\text{-环烷基}$ ；和
- [0725] 4-至10-元杂环烷基，
- [0726] R^{15} 选自
- [0727] 氢；
- [0728] $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ ，其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代： $-\text{OH}$ 和 $-\text{COOH}$ ；和
- [0729] 6-元杂芳基，
- [0730] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐，以及它们的混合物。
- [0731] 在第一方面的另一实施方案中，本发明涵盖上述式(I)的化合物，其中：
- [0732] R^2 选自
- [0733] 氢、卤素、 $-\text{C}(\text{O})-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})_2$
- [0734] $-\text{NR}^{12}\text{R}^{13}$ ；
- [0735] $-\text{OR}^{14}$ ；
- [0736] $-\text{SR}^{15}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^{15}$ ；
- [0737] $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_3-\text{C}_6\text{-环烷基}$ 、 $\text{C}_2-\text{C}_4\text{-烯基}$ 或 $\text{C}_3-\text{C}_6\text{-环烯基}$ ，其各自任选地被1、2、3、4或5个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-\text{OH}$ 、氰基、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷氧基}$ - $\text{C}(\text{O})-$ 和 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷氧基}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})_2$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})(\text{C}(\text{O})-\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})$ ；和
- [0738] 选自以下的单环或双环杂环：4-至10-元杂环烷基、杂螺环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基，其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代：卤素、 $-\text{OH}$ 、氧代、 $-\text{COOH}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷氧基}$ - $\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})-\text{NH}_2$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}-\text{C}(\text{O})-$ 、具有1至5个卤素原子的 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-卤代烷基}$ 、羟基- $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷氧基}$ - $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{N}(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})_2$ ，

和 4-至10-元杂环烷基,

[0739] R^{12} 和 R^{13} 独立地选自

[0740] 氢、-NH(-C(O)- C_1 - C_4 -烷基)、 C_1 - C_4 -烷氧基;

[0741] C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、苯基- C_1 - C_4 -烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、-COOH、 C_1 - C_4 -烷氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、-NH-C(O)- C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_3 - C_6 -环烷基、-NH₂、-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、-S- C_1 - C_4 -烷基、-S(O)- C_1 - C_4 -烷基、-SO₂- C_1 - C_4 -烷基和 (C_1 - C_4 -烷氧基)₂P(=O)-;

[0742] 杂环基- C_1 - C_4 -烷基,其中所述杂环基取代基选自4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、-OH、氧代、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基和 C_1 - C_4 -烷氧基;

[0743] 苯基和苯并- C_5 - C_6 -环烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基;和

[0744] 选自以下的单环或双环杂环: 4-至10-元杂环烷基、5-元杂芳基和6-元杂芳基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、氧代、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基,

[0745] R^{14} 选自

[0746] C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -环烷基、苯基- C_1 - C_4 -烷基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:卤素、-OH、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基和 C_3 - C_6 -环烷基;和

[0747] 4-至10-元杂环烷基,

[0748] R^{15} 选自

[0749] 氢;

[0750] C_1 - C_4 -烷基,其任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:-OH和-COOH;和

[0751] 6-元杂芳基,

[0752] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0753] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:

[0754] R^2 选自

[0755] 氢、氯,

[0756] -NR¹²R¹³;

[0757] -OR¹⁴;

[0758] -SR¹⁵、-S(O)R¹⁵、-SO₂R¹⁵;

[0759] 甲基、乙基、丙基、异丙基、环丙基、环己基、丙烯基、环戊烯基、环己烯基,其各自任选地被1或2个独立地选自下述的取代基取代:氰基、乙氧基-C(O)-和 -C(O)-NH₂;和

[0760] 选自以下的单环或双环杂环:氮杂环丁烷、吡咯烷、吡唑烷、咪唑烷、1,2,4-三唑烷、哌啶、哌嗪、四氢吡啶、二氢-2H-吡喃、1,2-噁唑烷、1,2-噁嗪、吗啉、硫代吗啉、3,4-二氢异喹啉、2,3-二氢-吡啶、1,3-二氢-异吡啶、3,9-二氧杂-7-氮杂双环[3.3.1]壬烷、6-氧杂-3-氮杂双环[3.1.1]庚烷、8-氧杂-3-氮杂双环[3.2.1]辛烷、咪唑、吡唑、1,2,4-三唑、1,2,

3-三唑、4-氧杂-7-氮杂螺[2.5]辛烷,其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代:氟、氯、氰基、-OH、氧代、-COOH、甲氧基-C(O)-、乙氧基-C(O)-、叔丁氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、甲基、甲基-C(O)-、三氟甲基、羟基甲基-、甲氧基甲基-、-NH₂、-NMe₂、吡咯烷,

[0761] R¹² 和R¹³ 独立地选自

[0762] 氢、-NH(-C(O)-甲基)、甲氧基;

[0763] 甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、环丙基、环丁基、苄基、1-苯基乙基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:氟、-OH、-COOH、甲氧基-C(O)-、乙氧基-C(O)-、叔丁氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NMe₂、-NH-C(O)-甲基、甲基、甲氧基、环丙基、-NH₂、NMe₂、S-甲基、S(O)-甲基、SO₂-甲基、和(EtO)₂P(=O)-;

[0764] 杂环基-甲基、杂环基-乙基,其中所述杂环基取代基选自吡咯烷、吗啉、吡唑、1,2,4-噁二唑、吡啶,其各自任选地被1个独立地选自以下的取代基取代:氟、氯、-OH、氧代和甲基;

[0765] 苯基;

[0766] 2,3-二氢-1H-茛,和

[0767] 选自以下的单环或双环杂环:氧杂环丁烷、硫杂环丁烷、吡咯烷、吗啉、四氢吡喃、吡啶和吡唑,其各自任选地被1或2个独立地选自下述的取代基取代:氟、氯、-OH、氧代、甲基;

[0768] R¹⁴ 选自

[0769] 甲基、乙基、异丙基、丁基、环戊基、苄基,其各自任选地被1或2个独立地选自下述的取代基取代:氟、-OH、甲基、甲氧基和环戊基;和

[0770] 选自以下的单环或双环杂环:吡咯烷和四氢吡喃,

[0771] R¹⁵ 选自

[0772] 甲基和乙基,其各自任选地被1个独立地选自下述的取代基取代:-OH和-COOH;和

[0773] 吡啶,

[0774] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0775] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:

[0776] R² 选自

[0777] 氢、氯、碘、-C(O)-N(CH₃)₂,

[0778] -NR¹²R¹³;

[0779] -OR¹⁴;

[0780] -SR¹⁵、-S(O)R¹⁵、-SO₂R¹⁵;

[0781] 甲基、乙基、丙基、异丙基、环丙基、环丁基、环戊基、环己基、乙烯基、丙烯基、环戊烯基、环己烯基,其各自任选地被1或2个独立地选自下述的取代基取代:-OH、氰基、乙氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、甲氧基、NH₂、N(CH₃)₂、N(CH₃)(C(O)CH₃);和

[0782] 选自以下的单环或双环杂环:氮杂环丁烷、氧杂环丁烷、吡咯烷、四氢呋喃、吡唑烷、咪唑烷、1,2,4-三唑烷、哌啶、哌嗪、四氢吡啶、二氢-2H-吡喃、1,2-噁唑烷、1,2-噁嗪、吗啉、硫代吗啉、3,4-二氢异喹啉、2,3-二氢-吡啶、1,3-二氢-异吡啶、3,9-二氧杂-7-氮杂双环[3.3.1]壬烷、6-氧杂-3-氮杂双环[3.1.1]庚烷、8-氧杂-3-氮杂双环[3.2.1]辛烷、噻吩、

咪唑、吡唑、1,2,4-三唑、1,2,3-三唑、1,2,3,4-四唑、吡啶、二氢吡啶、嘧啶、四氢嘧啶、4-氧杂-7-氮杂螺[2.5]辛烷,其各自任选地被1、2、3或4个独立地选自以下的取代基取代:氟、氯、氰基、-OH、氧代、-COOH、甲氧基-C(O)-、乙氧基-C(O)-、叔丁氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、甲基、甲氧基-C(O)-、二氟甲基、三氟甲基、羟基甲基-、甲氧基甲基-、-NH₂、-NMe₂、吡咯烷,

[0783] R¹² 和R¹³ 独立地选自

[0784] 氢、-NH(-C(O)-甲基)、甲氧基;

[0785] 甲基、乙基、丙基、异丙基、丁基、异丁基、环丙基、环丁基、苄基、1-苯基乙基,其各自任选地被1、2或3个独立地选自以下的取代基取代:氟、-OH、-COOH、甲氧基-C(O)-、乙氧基-C(O)-、叔丁氧基-C(O)-、-C(O)-NH₂、-C(O)-NMe₂、-NH-C(O)-甲基、甲基、甲氧基、环丙基、-NH₂、NMe₂、S-甲基、S(O)-甲基、SO₂-甲基、和(EtO)₂P(=O)-;

[0786] 杂环基-甲基、杂环基-乙基,其中所述杂环基取代基选自氧杂环丁烷、四氢呋喃、四氢吡喃、吡咯烷、吗啉、吡唑、咪唑、1,2,4-噁二唑、吡啶,其各自任选地被1个独立地选自以下的取代基取代:氟、氯、-OH、氧代和甲基;

[0787] 苯基;

[0788] 2,3-二氢-1H-茛,和

[0789] 选自以下的单环或双环杂环:氧杂环丁烷、硫杂环丁烷、吡咯烷、吗啉、四氢吡喃、吡啶和吡唑,其各自任选地被1或2个独立地选自下述的取代基取代:氟、氯、-OH、氧代、甲基;

[0790] R¹⁴ 选自

[0791] 甲基、乙基、异丙基、丁基、环戊基、苄基,其各自任选地被1或2个独立地选自下述的取代基取代:氟、-OH、甲基、甲氧基和环戊基;和

[0792] 选自以下的单环或双环杂环:吡咯烷和四氢吡喃,

[0793] R¹⁵ 选自

[0794] 甲基和乙基,其各自任选地被1个独立地选自下述的取代基取代:-OH和-COOH;和

[0795] 吡啶,

[0796] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0797] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:

[0798] R_p 是氢或C₁-C₄-烷基,

[0799] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0800] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:

[0801] R_p 是氢或甲基,

[0802] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0803] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:

[0804] R³ 是氢或C₁-C₄-烷基,

[0805] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

- [0806] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:
- [0807] R^3 是氢或甲基,
- [0808] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。
- [0809] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:
- [0810] R^4 选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基,
- [0811] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。
- [0812] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:
- [0813] R^4 选自氢、卤素、-OH、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 NH_2 ,
- [0814] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。
- [0815] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:
- [0816] R^4 选自氢、氯、氟、氰基、甲基、甲氧基和三氟甲基,
- [0817] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。
- [0818] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:
- [0819] R^4 选自氢、氯、氟、-OH、氰基、甲基、甲氧基、三氟甲基、三氟甲氧基和 NH_2 ,
- [0820] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。
- [0821] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:
- [0822] R^5 选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基,
- [0823] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。
- [0824] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:
- [0825] R^5 选自氢、卤素、-OH、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基,
- [0826] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。
- [0827] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:
- [0828] R^5 选自氢、氯、氟和甲基,
- [0829] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。
- [0830] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:
- [0831] R^5 选自氢、氯、氟、-OH、氰基、甲基、甲氧基和三氟甲基,
- [0832] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

物。

[0833] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式 (I) 的化合物,其中:

[0834] R^6 选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基,

[0835] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0836] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式 (I) 的化合物,其中:

[0837] R^6 选自氢、卤素、-OH、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基,

[0838] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0839] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式 (I) 的化合物,其中:

[0840] R^6 选自氢、氟、氯和甲基,

[0841] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

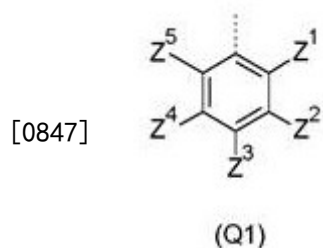
[0842] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式 (I) 的化合物,其中:

[0843] R^6 选自氢、氟、氯、-OH、氰基、甲基和甲氧基,

[0844] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0845] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式 (I) 的化合物,其中:

[0846] Q 是式 (Q1) 的取代的苯基环



[0848] 其中:

[0849] Z^1 、 Z^2 、 Z^3 、 Z^4 、和 Z^5 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、羟基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、任选地被1或2个选自氟、氯、溴、甲基和氰基的取代基取代的4-至6-元杂环基、-S-(C_1 - C_4 -烷基)、-S(O)-(C_1 - C_4 -烷基)、-SO₂-(C_1 - C_4 -烷基),或

[0850] Z^1 和 Z^2 与它们所连接的碳原子一起形成5-或6-元的杂环烷基、5-元杂芳基或6-元杂芳基,其各自可任选地被一个或两个选自下述的取代基取代:甲基、氟和氧代,和

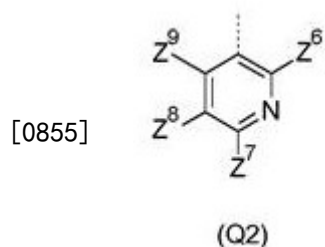
[0851] Z^3 、 Z^4 、和 Z^5 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、 C_1 - C_4 -烷氧基-C(O)-、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基,或

[0852] Z^2 和 Z^3 与它们所连接的碳原子一起形成5-或6-元的饱和或部分饱和的杂环、5-元杂芳基或6-元杂芳基,其各自可任选地被一个或两个选自下述的取代基取代:甲基、氟和

氧代,和

[0853] Z^1 、 Z^4 、和 Z^5 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基,或

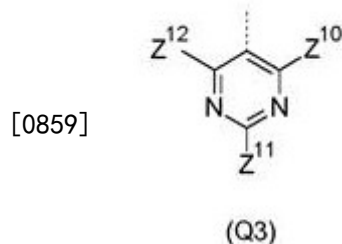
[0854] Q 是式(Q2)的吡啶环



[0856] 其中:

[0857] Z^6 、 Z^7 、 Z^8 和 Z^9 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-N(C_1 - C_4 -烷基)₂,或

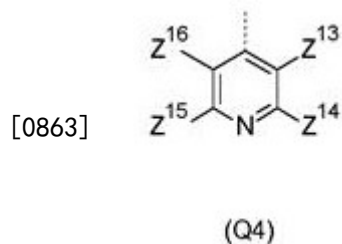
[0858] Q 是式(Q3)的嘧啶环



[0860] 其中:

[0861] Z^{10} 、 Z^{11} 和 Z^{12} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-N(C_1 - C_4 -烷基)₂,或

[0862] Q 是式(Q4)的吡啶环

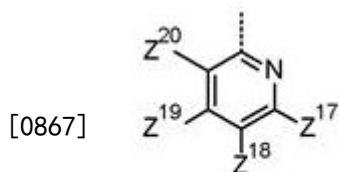


[0864] 其中:

[0865] Z^{13} 、 Z^{14} 、 Z^{15} 和 Z^{16} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_1 - C_4 -羟基烷基、NH₂、-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、-NH-CO- C_1 - C_4 -烷基,和选自下述的单环杂环:4-至7-元杂环烷基或具有至少一个氮原子的5-元杂芳基,所述杂芳基环通过该氮原子与所述吡啶环相连,其各自任选地被1、2或3个独立地选自下述的取代基取代:卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、 C_1 - C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1 - C_4 -卤代烷氧基、 C_3 - C_6 -环烷基、-NH₂、-NH(C_1 - C_4 -烷基)、-N(C_1 - C_4 -烷基)₂、-

S-C₁-C₄-烷基、-S(O)-C₁-C₄-烷基、-SO₂-C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的-S-(C₁-C₄-卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-S(O)-(C₁-C₄-卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的-SO₂-(C₁-C₄-卤代烷基),或

[0866] Q 是式(Q5)的吡啶环



(Q5)

[0868] 其中:

[0869] Z¹⁷、Z¹⁸、Z¹⁹ 和 Z²⁰ 独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的 C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C₁-C₄-卤代烷氧基、-NH(C₁-C₄-烷基)、-N(C₁-C₄-烷基)₂,或

[0870] Q 是式(Q6)的5元芳族杂环



(Q6)

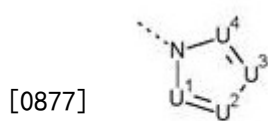
[0872] 其中:

[0873] T¹ - T⁴ 独立地选自N、O、S、C-Z²¹ 和N-Z²²,其中T¹-T⁴ 中不超过一个是O,T¹-T⁴ 中不超过一个是S,T¹-T⁴ 中不超过一个是N-Z²²,并且其中

[0874] 每个Z²¹ 独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基,和

[0875] 每个Z²² 独立地选自氢、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷基-C₃-C₆-环烷基、C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基,或

[0876] Q 是式(Q7)的5-元芳族杂环



(Q7)

[0878] 其中:

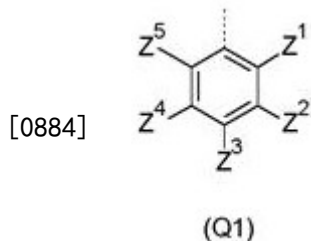
[0879] U¹ - U⁴ 独立地选自N和C-Z²³,其中U¹ -U⁴中不超过三个是N,并且其中

[0880] 每个Z²³ 独立地选自氢、卤素、氰基、C₁-C₄-烷基、具有1至5个卤素原子的C₁-C₄-卤代烷基、C₁-C₄-烷氧基,

[0881] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0882] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:

[0883] Q 是式 (Q1) 的取代的苯基环



[0885] 其中:

[0886] Z^1 和 Z^5 独立地选自氢、卤素、 C_1-C_4 -烷基和 C_1-C_4 -烷氧基,

[0887] Z^2 和 Z^4 独立地选自氢、卤素、-OH、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、-S-(C_1-C_4 -烷基) 和4-至6-元杂环烷基, 和

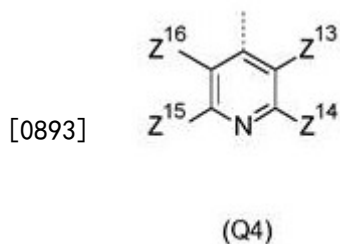
[0888] Z^3 选自氢、卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基和 -N(C_1-C_4 -烷基)₂, 或

[0889] Z^1 和 Z^2 与它们所连接的碳原子一起形成5-元杂环烷基或5-元杂芳基, 其各自可任选地被一个或两个选自下述的取代基取代: 甲基、氟和氧代,

[0890] Z^3 和 Z^5 是氢, 和

[0891] Z^4 选自氢和 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-, 或

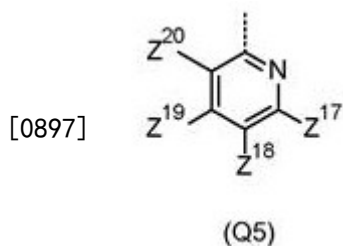
[0892] Q 是式 (Q4) 的吡啶环



[0894] 其中:

[0895] Z^{13} 、 Z^{14} 、 Z^{15} 和 Z^{16} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -羟基烷基、 NH_2 、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-NH-CO- C_1-C_4 -烷基, 和选自下述的单环杂环: 4-7元杂环烷基或具有至少一个氮原子的5-元杂芳基, 所述杂芳基环通过该氮原子与所述吡啶环相连, 其各自任选地被1、2或3个独立地选自下述的取代基取代: 卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、- NH_2 、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、-SO₂- C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 -S-(C_1-C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的 -S(O)-(C_1-C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的 -SO₂-(C_1-C_4 -卤代烷基), 或

[0896] Q 是式 (Q5) 的吡啶环

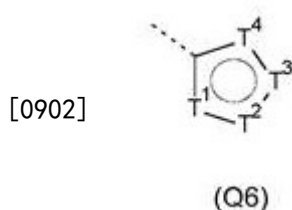


[0898] 其中:

[0899] Z^{17} 、 Z^{18} 、和 Z^{19} 是氢,和

[0900] Z^{20} 是卤素,或

[0901] Q 是式(Q6)的5元芳族杂环



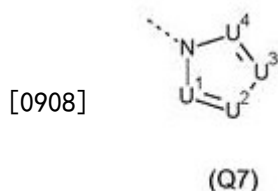
[0903] 其中:

[0904] $T^1 - T^4$ 独立地选自N、O、S、C- Z^{21} 和N- Z^{22} ,其中 T^1-T^4 中不超过一个是O, T^1-T^4 中不超过一个是S, T^1-T^4 中不超过一个是N- Z^{22} ,并且其中

[0905] 每个 Z^{21} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基,和

[0906] 每个 Z^{22} 独立地选自氢、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷基- C_3-C_6 -环烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基,或

[0907] Q 是式(Q7)的5元芳族杂环



[0909] 其中:

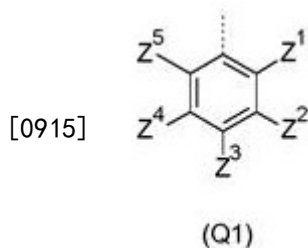
[0910] $U^1 - U^4$ 独立地选自N和C- Z^{23} ,其中 $U^1 - U^4$ 中不超过三个是N,并且其中

[0911] 每个 Z^{23} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基,

[0912] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0913] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:

[0914] Q 是式(Q1)的取代的苯基环



[0916] 其中:

[0917] Z^1 和 Z^5 独立地选自氢、卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基和具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基,

[0918] Z^2 和 Z^4 独立地选自氢、卤素、氰基、-OH、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、-S-(C_1-C_4 -烷基) 和4-至6-元杂环烷基, 和

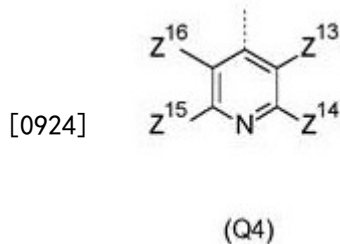
[0919] Z^3 选自氢、卤素、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基 和 -N(C_1-C_4 -烷基)₂, 或

[0920] Z^1 和 Z^2 与它们所连接的碳原子一起形成5-元杂环烷基或5-元杂芳基, 其各自可任选地被一个或两个选自下述的取代基取代: 甲基、氟和氧代,

[0921] Z^3 和 Z^5 是氢, 和

[0922] Z^4 选自氢和 C_1-C_4 -烷氧基-C(O)-, 或

[0923] Q 是式(Q4)的吡啶环

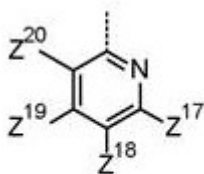


[0925] 其中:

[0926] Z^{13} 、 Z^{14} 、 Z^{15} 和 Z^{16} 独立地选自氢、卤素、氰基、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、 C_1-C_4 -羟基烷基、 NH_2 、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-NH-CO- C_1-C_4 -烷基, 和选自下述的单环杂环: 4-至7-元杂环烷基或具有至少一个氮原子的5-元杂芳基, 所述杂芳基环通过该氮原子与所述吡啶环相连, 其各自任选地被1、2或3个独立地选自下述的取代基取代: 卤素、氰基、硝基、-OH、氧代、硫羰基、 C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、具有1至5个卤素原子的 C_1-C_4 -卤代烷氧基、 C_3-C_6 -环烷基、- NH_2 、-NH(C_1-C_4 -烷基)、-N(C_1-C_4 -烷基)₂、-S- C_1-C_4 -烷基、-S(O)- C_1-C_4 -烷基、- SO_2 - C_1-C_4 -烷基、具有1至5个卤素原子的 -S-(C_1-C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的 -S(O)-(C_1-C_4 -卤代烷基)、具有1至5个卤素原子的 - SO_2 -(C_1-C_4 -卤代烷基), 或

[0927] Q 是式(Q5)的吡啶环

[0928]



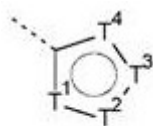
(Q5)

[0929] 其中:

[0930] Z^{17} 、 Z^{18} 、和 Z^{19} 是氢,和[0931] Z^{20} 是卤素,或

[0932] Q 是式 (Q6) 的5-元芳族杂环

[0933]



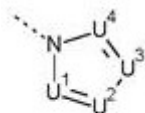
(Q6)

[0934] 其中:

[0935] $T^1 - T^4$ 独立地选自N、O、S、C- Z^{21} 和N- Z^{22} ,其中 $T^1 - T^4$ 中不超过一个是O, $T^1 - T^4$ 中不超过一个是S, $T^1 - T^4$ 中不超过一个是N- Z^{22} ,并且其中[0936] 每个 Z^{21} 独立地选自氢、卤素、氰基、 $C_1 - C_4$ -烷基、具有1至5个卤素原子的 $C_1 - C_4$ -卤代烷基、 $C_1 - C_4$ -烷氧基,和[0937] 每个 Z^{22} 独立地选自氢、 $C_1 - C_4$ -烷基、具有1至5个卤素原子的 $C_1 - C_4$ -卤代烷基、 $C_1 - C_4$ -烷基- $C_3 - C_6$ -环烷基、 $C_1 - C_4$ -烷氧基- $C_1 - C_4$ -烷基,或

[0938] Q 是式 (Q7) 的5-元芳族杂环

[0939]



(Q7)

[0940] 其中:

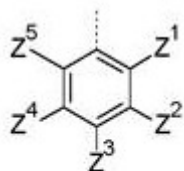
[0941] $U^1 - U^4$ 独立地选自N和C- Z^{23} ,其中 $U^1 - U^4$ 中不超过三个是N,并且其中[0942] 每个 Z^{23} 独立地选自氢、卤素、氰基、 $C_1 - C_4$ -烷基、具有1至5个卤素原子的 $C_1 - C_4$ -卤代烷基、 $C_1 - C_4$ -烷氧基,

[0943] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0944] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式 (I) 的化合物,其中:

[0945] Q 是式 (Q1) 的取代的苯基环

[0946]



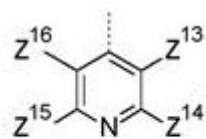
(Q1)

[0947] 其中:

[0948] Z^1 和 Z^5 独立地选自氢、氟、氯、甲基和甲氧基,[0949] Z^2 和 Z^4 独立地选自氢、氟、氯、-OH、甲基、乙基、-NHMe、-NMe₂、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、-SMe和吗啉基,和[0950] Z^3 独立地选自氢、氟、氯、甲基、甲氧基和-NMe₂,或

[0951] Q 是式 (Q4) 的吡啶环

[0952]



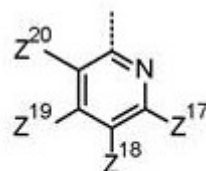
(Q4)

[0953] 其中:

[0954] Z^{13} 、 Z^{14} 、 Z^{15} 和 Z^{16} 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、甲氧基、乙氧基、异丙氧基、羟甲基、NH₂、-NHMe、-NMe₂、-NH-C(O)-Me、吗啉基,或

[0955] Q 是式 (Q5) 的吡啶环

[0956]



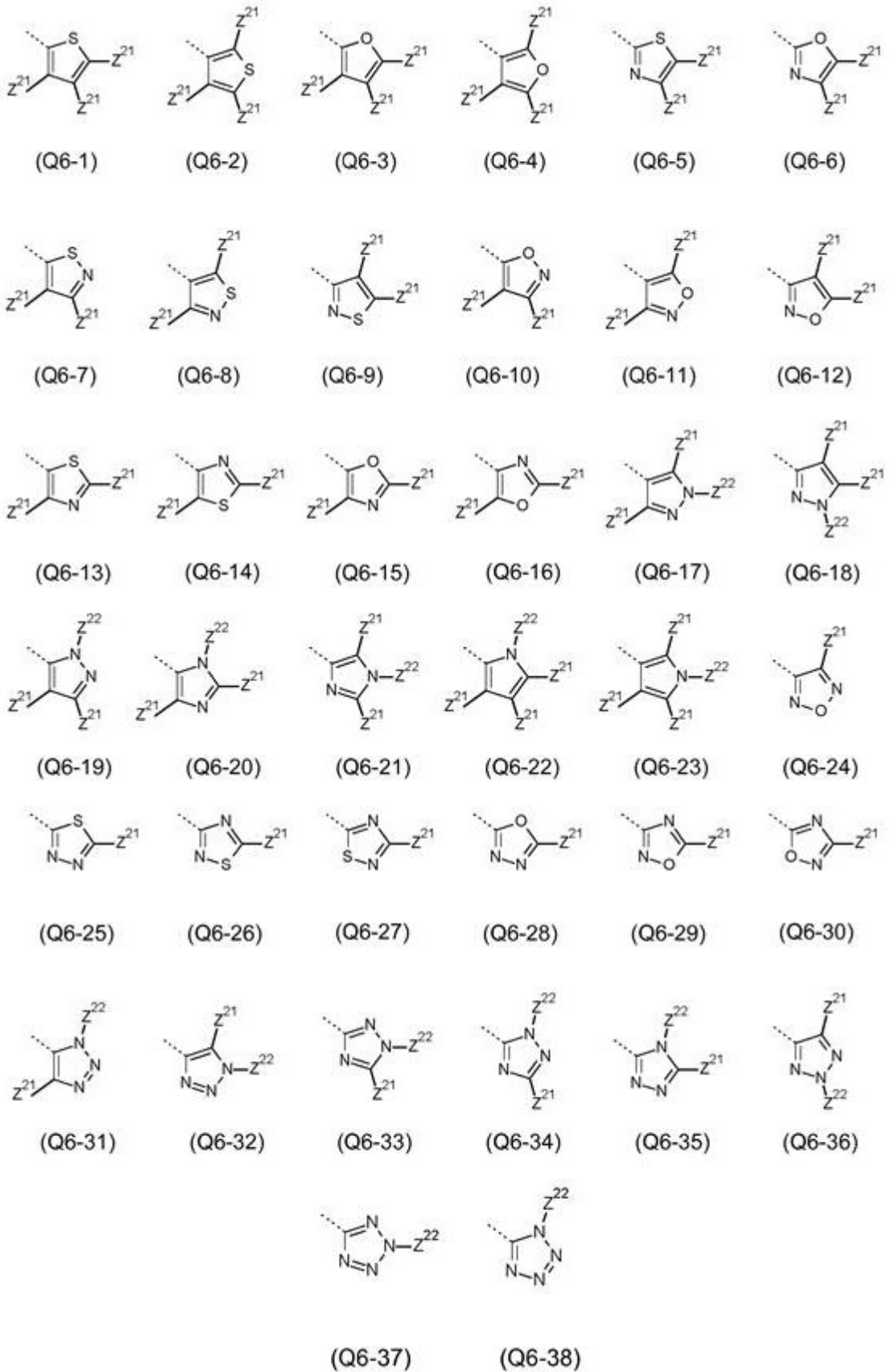
(Q5)

[0957] 其中:

[0958] Z^{17} 、 Z^{18} 、和 Z^{19} 是氢,和[0959] Z^{20} 是氟、氯,或

[0960] Q 选自

[0961]

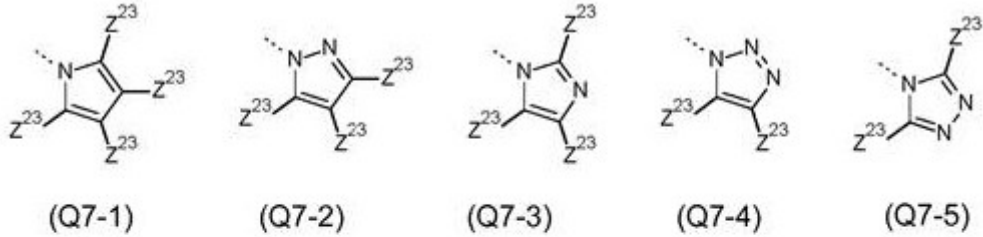


[0962] 其中：

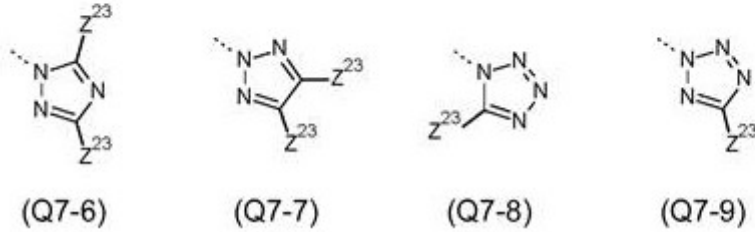
[0963] 每个 Z^{21} 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基和

[0964] Z^{22} 是氢、甲基、或

[0965] Q 选自



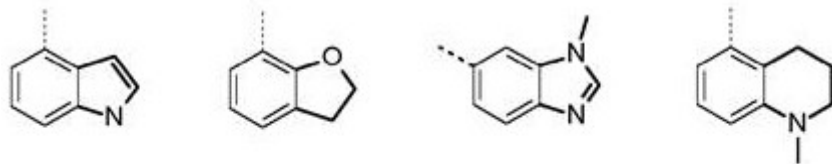
[0966]



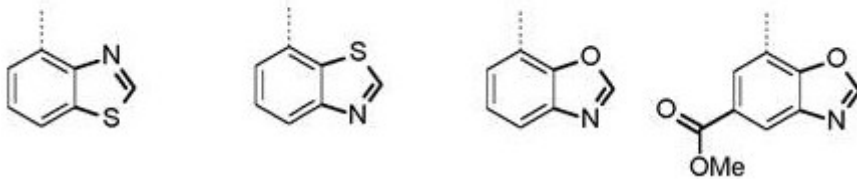
[0967] 其中:

[0968] 每个Z²³ 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基,或

[0969] Q 选自



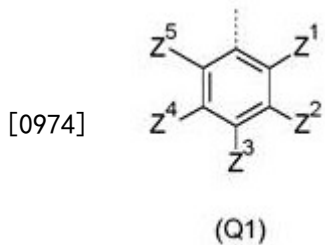
[0970]



[0971] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[0972] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:

[0973] Q 是式(Q1)的取代的苯基环



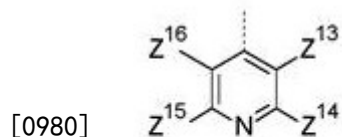
[0975] 其中:

[0976] Z¹ 和Z⁵ 独立地选自氢、氟、氯、甲基、甲氧基和三氟甲基,

[0977] Z² 和Z⁴ 独立地选自氢、氟、氯、-OH、氰基、甲基、乙基、叔丁基、-NHMe、-NMe₂、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、-SMe和吗啉基,和

[0978] Z³ 独立地选自氢、氟、氯、甲基、甲氧基、二氟甲氧基和-NMe₂,或

[0979] Q 是式 (Q4) 的吡啶环

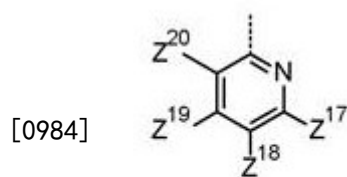


(Q4)

[0981] 其中:

[0982] Z^{13} 、 Z^{14} 、 Z^{15} 和 Z^{16} 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、甲氧基、乙氧基、异丙氧基、羟基甲基、 NH_2 、 -NHMe 、 -NMe_2 、 -NH-C(O)-Me 、吗啉基,或

[0983] Q 是式 (Q5) 的吡啶环



(Q5)

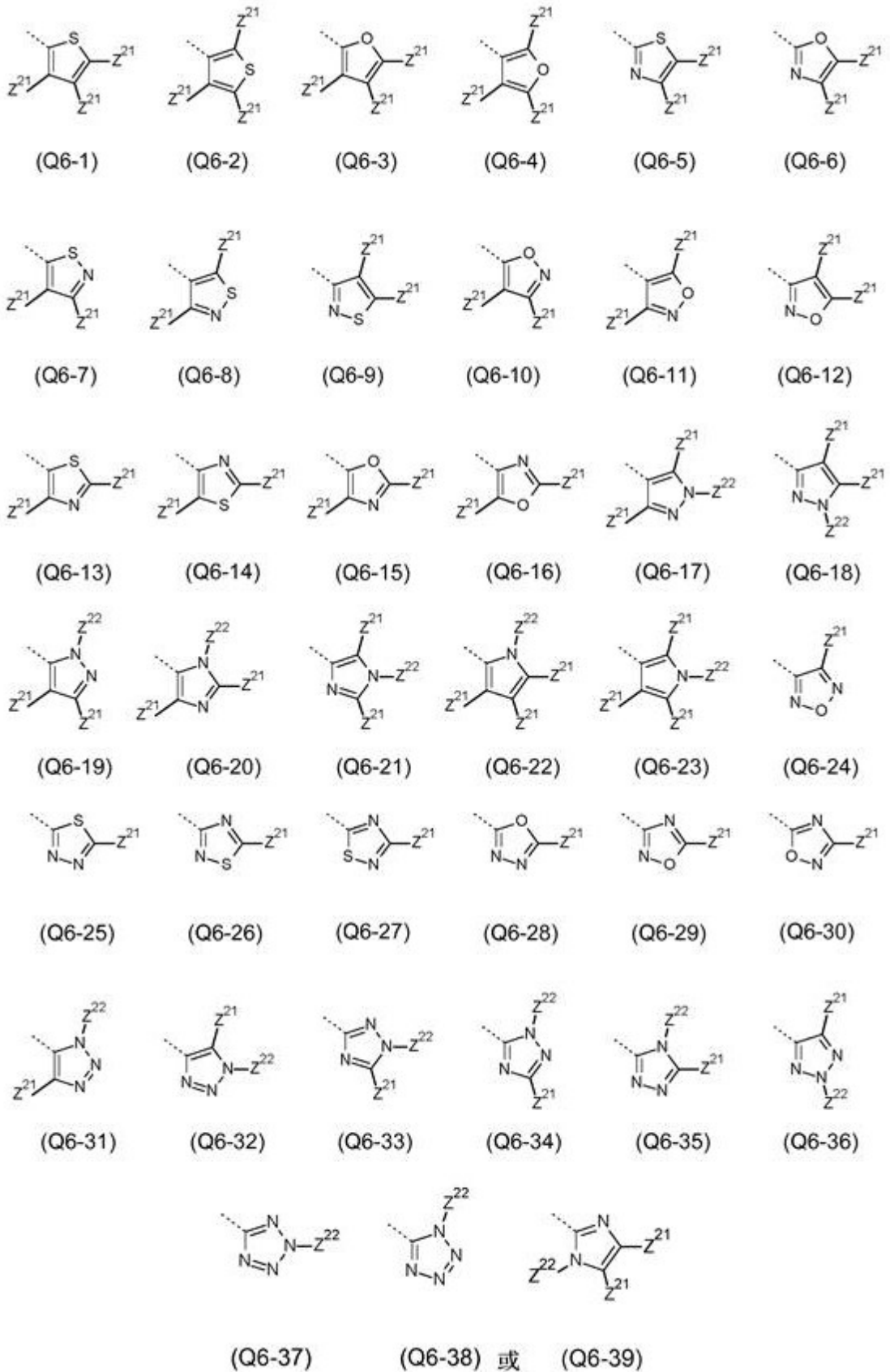
[0985] 其中:

[0986] Z^{17} 、 Z^{18} 、和 Z^{19} 是氢,和

[0987] Z^{20} 是氟、氯,或

[0988] Q 选自

[0989]

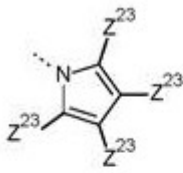


[0990] 其中：

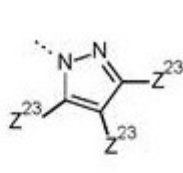
[0991] 每个Z²¹ 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基和

[0992] Z²² 是氢、甲基、或

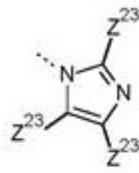
[0993] Q 选自



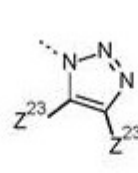
(Q7-1)



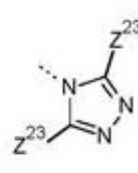
(Q7-2)



(Q7-3)

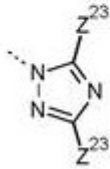


(Q7-4)

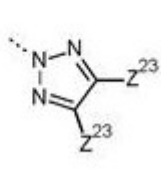


(Q7-5)

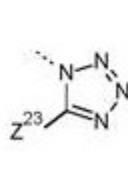
[0994]



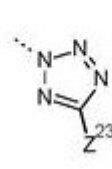
(Q7-6)



(Q7-7)



(Q7-8)

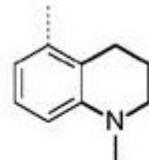
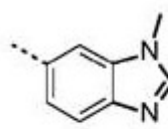
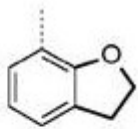
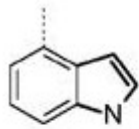


(Q7-9)

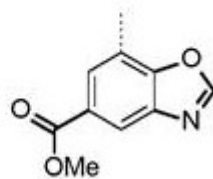
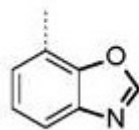
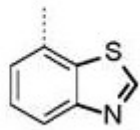
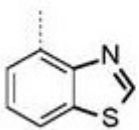
[0995] 其中:

[0996] 每个 Z^{23} 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基,或

[0997] Q 选自



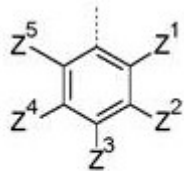
[0998]



[0999] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[1000] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式(I)的化合物,其中:

[1001] Q 是式(Q1)的取代的苯基环



[1002]

(Q1)

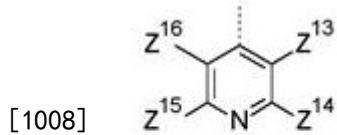
[1003] 其中:

[1004] Z^1 和 Z^5 独立地选自氢、氟、氯、甲基、甲氧基和三氟甲基,

[1005] Z^2 和 Z^4 独立地选自氢、氟、氯、-OH、氰基、甲基、乙基、叔丁基、-NHMe、-NMe₂、三氟甲基、甲氧基、三氟甲氧基、-SMe和吗啉基,和

[1006] Z^3 独立地选自氢、氟、氯、甲基、甲氧基、二氟甲氧基和-NMe₂,或

[1007] Q 是式 (Q4) 的吡啶环

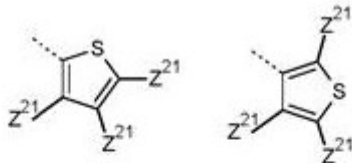


(Q4)

[1009] 其中:

[1010] Z^{13} 、 Z^{14} 、 Z^{15} 和 Z^{16} 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、甲氧基、乙氧基、异丙氧基、羟基甲基、 NH_2 、 $-\text{NHMe}$ 、 $-\text{NMe}_2$ 、 $-\text{NH}-\text{C}(\text{O})-\text{Me}$ 、吗啉基,或

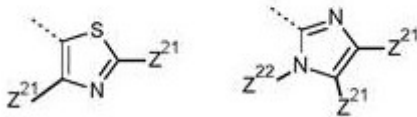
[1011] Q 选自



(Q6-1)

(Q6-2)

[1012]



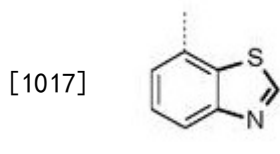
(Q6-13) 或 (Q6-39)

[1013] 其中:

[1014] 每个 Z^{21} 独立地选自氢、氟、氯、氰基、甲基、三氟甲基、甲氧基和

[1015] Z^{22} 是氢、甲基,或

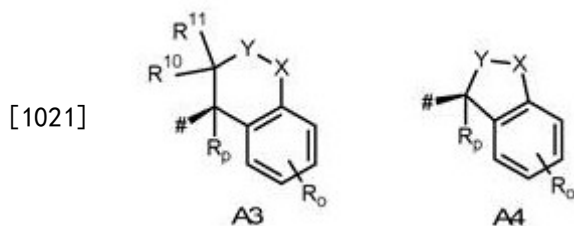
[1016] Q 选自



[1018] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[1019] 在第一方面的另一实施方案中,本发明涵盖上述式 (I) 的化合物,其中

[1020] A 是A3或A4



[1022] 其中

[1023] R_p 选自氢、 C_1-C_4 -烷基；优选氢，

[1024] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐，以及它们的混合物。

[1025] 在本发明的另一方面，在根据第一至第八方面的任何或所有实施方案中（包括在标题“本发明的第一方面的另外的实施方案”下的实施方案）中，在X和/或Y的定义中，如上文所定义的“NR⁹”被排除在外。

[1026] 在本发明的另一方面，在根据第一至第八方面的任何或所有实施方案中（包括在标题“本发明的第一方面的另外的实施方案”下的实施方案）中，在R²的定义中，氢被排除在外。

[1027] 在第一方面的另一个特别的实施方案中，本发明涵盖在标题“本发明的第一方面的另外的实施方案”下的两个或更多个上述实施方案的组合。

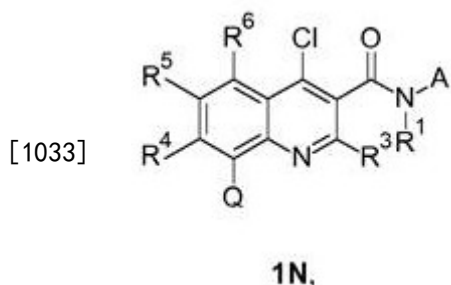
[1028] 本发明涵盖上述通式(I)的化合物的本发明的任意实施方案或方面内的任意子组合。

[1029] 本发明涵盖下述本文文本的实施例部分中公开的通式(I)的化合物。

[1030] 根据本发明所述的通式(I)的化合物可以根据如在本发明的实验部分（一般程序）中示出的方案1a-e、2、3和4制备。所述方案和程序描述说明了得到本发明的通式(I)的化合物的合成路线，且并不意图是限定性的。对本领域技术人员而言明确的是，如方案1a-e、2和3中示例的转化的顺序可能以多种方式进行修改。这些方案中示例的转化的顺序因此并不意图是限定性的。此外，任意取代基Q、A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵ 或者R⁶的互相转化可以在示例的转化之前和/或之后实现。这些修改可以是诸如引入保护基、裂解保护基、还原或氧化官能团、卤化、金属化、取代，或者对本领域技术人员而言已知的其它反应。这些转化包括引入允许进一步的取代基互相转化的官能性的那些。适合的保护基以及它们的引入和裂解是本领域技术人员公知的（参见例如T.W.Greene和P.G.M.Wuts, *Protective Groups in Organic Synthesis*, 第3版, Wiley 1999）。具体实施例在随后的段落中描述。

[1031] 下文中，用于制备通式(I)的化合物的几条路线被描述于方案1a-e 和2中。

[1032] 根据第二方面，本发明涵盖制备如上文所定义的通式(I)的化合物的方法，所述方法包括下述步骤：使通式1N的中间体化合物

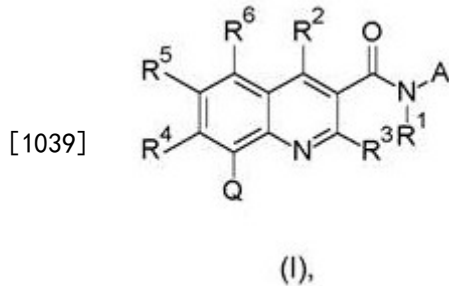


[1034] 其中 A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶和 Q如上文定义的通式(I)的化合物所定义，

[1035] 与通式1F的化合物反应：

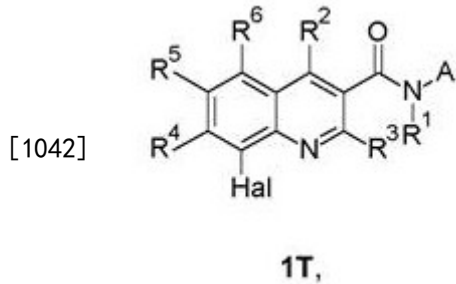
[1036] R^2H
1F,

[1037] 其中 R^2 是 $NR^{12}R^{13}$ 、 OR^{14} 或 SR^{15} , 各自如上文定义的通式 (I) 的化合物所定义,
 [1038] 由此提供通式 (I) 的化合物:



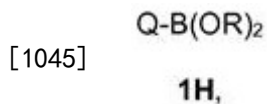
[1040] 其中 A、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 和 Q 如上文所定义。

[1041] 根据第二方面的一个替代的实施方案, 本发明涵盖制备如上文所定义的通式 (I) 的化合物的方法, 所述方法包括下述步骤: 使通式 1T 的中间体化合物



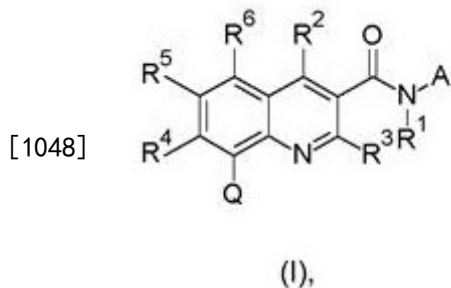
[1043] 其中 A、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 如上文定义的通式 (I) 的化合物所定义, 和其中 Hal 是卤素, 特别是氯、溴或碘,

[1044] 与通式 1H 的化合物反应:



[1046] 其中 Q 如上文定义的通式 (I) 的化合物所定义, 且每个 R 可以独立地为 H 或 Me, 或者两个 R 均为频哪醇基 (pinacolate),

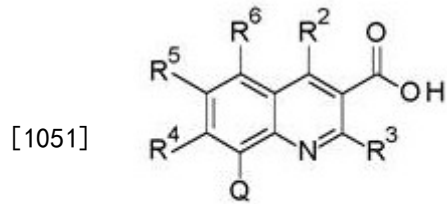
[1047] 由此提供通式 (I) 的化合物:



[1049] 其中 A、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 和 Q 如上文所定义。

[1050] 根据第二方面的一个替代的实施方案, 本发明涵盖制备如上文所定义的通式 (I)

的化合物的方法,所述方法包括下述步骤:使通式1W的中间体化合物



1W,

[1052] 其中 Q、R²、R³、R⁴、R⁵ 和R⁶如上文定义的通式(I)的化合物所定义,

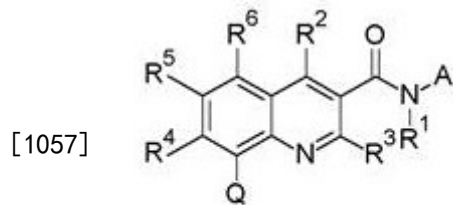
[1053] 与通式1M的化合物反应:



1M,

[1055] 其中 R¹ 和A如上文定义的通式(I)的化合物所定义,

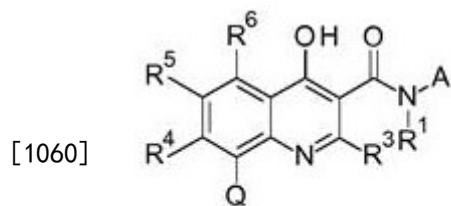
[1056] 由此提供通式(I)的化合物:



(I),

[1058] 其中 A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和 Q如上文所定义。

[1059] 根据第二方面的一个替代的实施方案,本发明涵盖制备如上文所定义的通式(I)的化合物的方法,所述方法包括下述步骤:使通式1X的中间体化合物



1X,

[1061] 其中 Q、A、R¹、R³、R⁴、R⁵ 和R⁶如上文定义的通式(I)的化合物所定义,

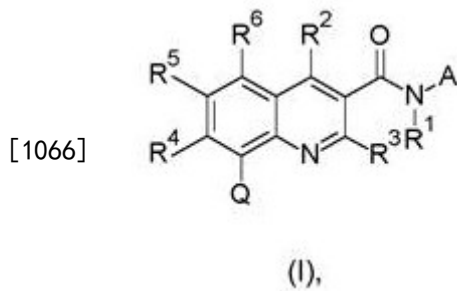
[1062] 与通式1Y的化合物反应:



1Y,

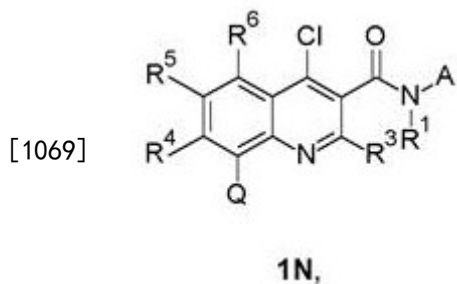
[1064] 其中 R²是如上文定义的通式(I)的化合物所定义的OR¹⁴ ,

[1065] 由此提供通式(I)的化合物:



[1067] 其中 A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶和 Q如上文所定义,和R² 是如上文所定义任选地被取代的C¹-C⁴-烷氧基。

[1068] 根据第二方面的一个替代的实施方案,本发明涵盖制备如上文所定义的通式(I)的化合物的方法,所述方法包括下述步骤:使通式1N的中间体化合物



[1070] 其中 Q、A、R¹、R³、R⁴、R⁵ 和R⁶如上文定义的通式(I)的化合物所定义,

[1071] 与通式2A的化合物反应:

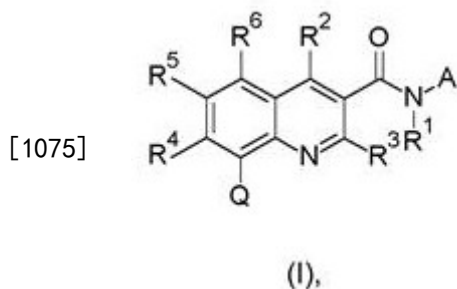


[1072]



[1073] 其中 R² 是C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₂-C₄-烯基、C₃-C₆-环烯基、C₂-C₄-炔基或苯基-C₁-C₄-烷基,其各自如上文定义的通式(I)的化合物所定义任选地被取代, Met是镁或锌,和 X是氯、溴或碘,

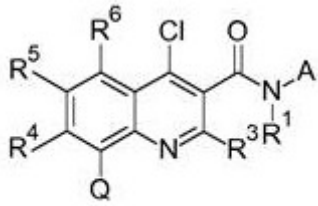
[1074] 由此提供通式(I)的化合物:



[1076] 其中 A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶和 Q如上文所定义,和R² 是C₁-C₄-烷基、C₃-C₆-环烷基、C₂-C₄-烯基、C₃-C₆-环烯基、C₂-C₄-炔基或苯基-C₁-C₄-烷基,其各自如上文所定义任选地被取代。

[1077] 根据第三方面,本发明涵盖制备如上文所定义的通式(I)的化合物的方法,所述方法包括下述步骤:使通式1N的中间体化合物:

[1078]

**1N,**[1079] 其中 A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶和 Q如上文定义的通式(I)的化合物所定义，

[1080] 与通式1F的化合物反应：

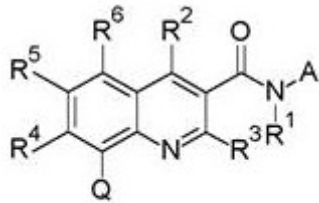


[1081]

[1082] 其中 R²是NR¹²R¹³、OR¹⁴或 SR¹⁵，各自如上文定义的通式(I)的化合物所定义，

[1083] 由此提供通式(I)的化合物：

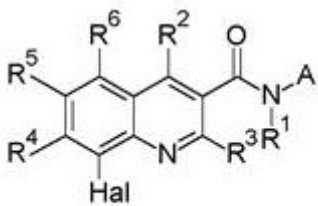
[1084]

**(I),**[1085] 其中A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和Q如上文所定义，

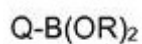
[1086] 然后，使用相应的(i)溶剂和/或(ii)碱或酸，任选地将所述化合物转化成溶剂合物、盐和/或这样的盐的溶剂合物。

[1087] 根据第三方面的一个替代的实施方案，本发明涵盖制备如上文所定义的通式(I)的化合物的方法，所述方法包括下述步骤：使通式1T的中间体化合物

[1088]

**1T,**[1089] 其中A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵和R⁶如上文定义的通式(I)的化合物所定义，和其中 Hal 是卤素，特别是氯、溴或碘，

[1090] 与通式1H的化合物反应：



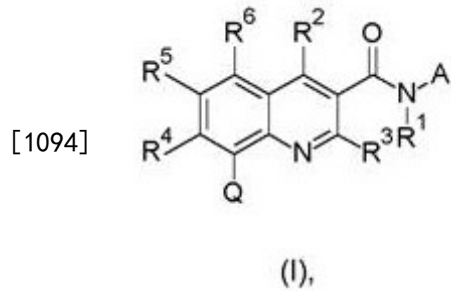
[1091]



[1092] 其中 Q 是如上文定义的通式(I)的化合物所定义，和每个R可以独立地为H或Me，

或者两个R均为频哪醇基，

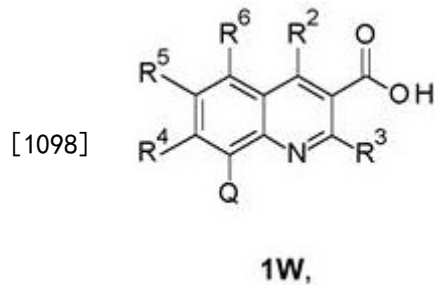
[1093] 由此提供通式 (I) 的化合物：



[1095] 其中 A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和 Q如上文所定义，

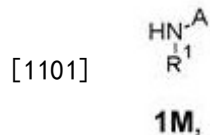
[1096] 然后，使用相应的 (i) 溶剂和/或 (ii) 碱或酸，任选地将所述化合物转化成溶剂合物、盐和/或这样的盐的溶剂合物。

[1097] 根据第三方面的一个替代的实施方案，本发明涵盖制备如上文所定义的通式 (I) 的化合物的方法，所述方法包括下述步骤：使通式1W的中间体化合物



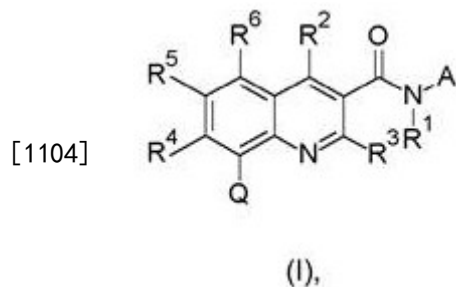
[1099] 其中 Q、R²、R³、R⁴、R⁵ 和R⁶如上文定义的通式 (I) 的化合物所定义，

[1100] 与通式1M的化合物反应：



[1102] 其中 R¹和A是如上文定义的通式 (I) 的化合物所定义，

[1103] 由此提供通式 (I) 的化合物：

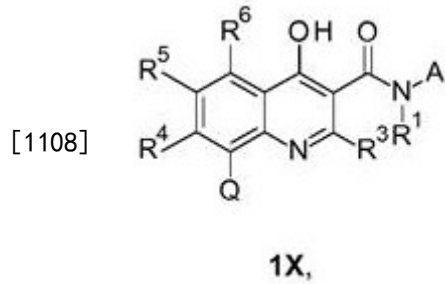


[1105] 其中 A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶和 Q如上文所定义，

[1106] 然后，使用相应的 (i) 溶剂和/或 (ii) 碱或酸，任选地将所述化合物转化成溶剂合物、盐和/或这样的盐的溶剂合物。

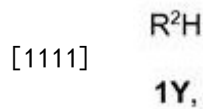
[1107] 根据第三方面的一个替代的实施方案，本发明涵盖制备如上文所定义的通式 (I)

的化合物的方法,所述方法包括下述步骤:使通式1X的中间体化合物

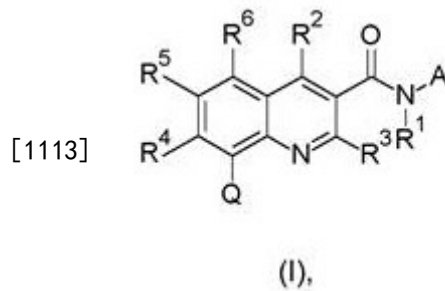


[1109] 其中 Q、A、R¹、R³、R⁴、R⁵ 和R⁶如上文定义的通式(I)的化合物所定义,

[1110] 与通式1Y的化合物反应:



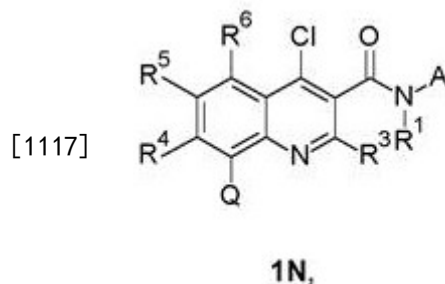
[1112] 其中 R²是如上文定义的通式(I)的化合物所定义的OR¹⁴,由此提供通式(I)的化合物:



[1114] 其中 A、R¹、R³、R⁴、R⁵、R⁶和 Q如上文所定义,和R² 是如上文所定义任选地被取代的C₁-C₄-烷氧基,

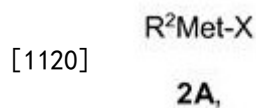
[1115] 然后,使用相应的(i)溶剂和/或(ii)碱或酸,任选地将所述化合物转化成溶剂合物、盐和/或这样的盐的溶剂合物。

[1116] 根据第三方面的一个替代的实施方案,本发明涵盖制备如上文所定义的通式(I)的化合物的方法,所述方法包括下述步骤:使通式1N的中间体化合物



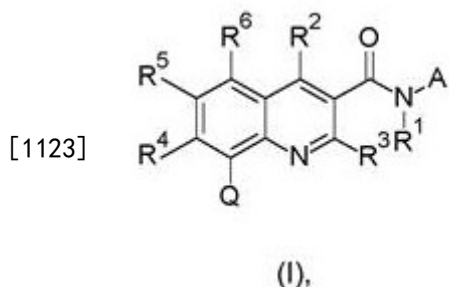
[1118] 其中 Q、A、R¹、R³、R⁴、R⁵ 和R⁶如上文定义的通式(I)的化合物所定义,

[1119] 与通式2A的化合物反应:



[1121] 其中 R^2 是 C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_3-C_6 -环烯基、 C_2-C_4 -炔基或苯基- C_1-C_4 -烷基,其各自如上文定义的通式(I)的化合物所定义任选地被取代, Met 是镁或锌,和 X是氯、溴或碘,

[1122] 由此提供通式(I)的化合物:



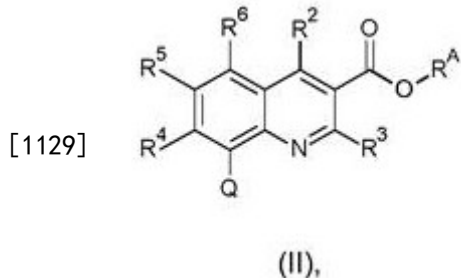
[1124] 其中 A、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 和 Q如上文所定义,和 R^2 是 C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_3-C_6 -环烯基、 C_2-C_4 -炔基或苯基- C_1-C_4 -烷基,其各自如上文所定义任选地被取代,

[1125] 然后,使用相应的(i)溶剂和/或(ii)碱或酸,任选地将所述化合物转化成溶剂合物、盐和/或这样的盐的溶剂合物。

[1126] 本发明涵盖制备本发明的通式(I)的化合物的方法,所述方法包括如在本文中实验部分中描述的步骤。

[1127] 根据第四方面,本发明涵盖可用于制备上述的通式(I)的化合物的中间体化合物。

[1128] 特别地,本发明涵盖通式(II)的中间体化合物:



[1130] 其中

[1131] R^2 是-OH或如上述通式(I)的化合物所定义,

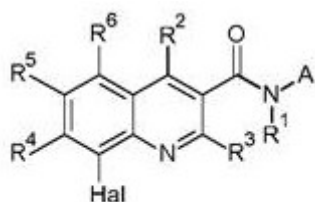
[1132] R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 和 Q是如上述通式(I)的化合物所定义,和

[1133] R^A 是H或 C_1-C_4 -烷基,

[1134] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[1135] 特别地,本发明也涵盖通式(III)的中间体化合物:

[1136]



(III),

[1137] 其中

[1138] R^2 是-OH或如上述通式(I)的化合物所定义,[1139] A、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 如上述通式(I)的化合物所定义,和

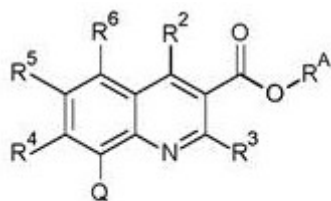
[1140] Hal 是卤素,

[1141] 及其立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂化物和盐,以及它们的混合物。

[1142] 根据第四方面,本发明涵盖所述中间体化合物用于制备如上文所定义的通式(I)的化合物的用途。

[1143] 特别地,本发明涵盖通式(II)的中间体化合物用于制备如上文所定义的通式(I)的化合物的用途:

[1144]



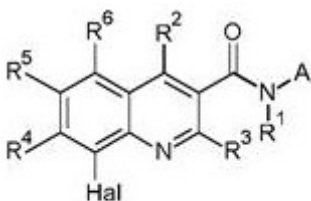
(II),

[1145] 其中

[1146] R^2 是-OH或如上述通式(I)的化合物所定义,[1147] R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 和 Q如上述通式(I)的化合物所定义,和[1148] R^A 是H或 C_1-C_4 -烷基。

[1149] 特别地,本发明也涵盖通式(III)的中间体化合物用于制备如上文所定义的通式(I)的化合物的用途:

[1150]



(III),

[1151] 其中

[1152] R^2 是-OH或如上述通式(I)的化合物所定义,[1153] A、 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 和 R^6 如上述通式(I)的化合物所定义,和

- [1154] Hal 是卤素。
- [1155] 本发明涵盖下述本文本的实施例部分中公开的中间体化合物。
- [1156] 本发明的通式 (I) 的化合物可以通过本领域技术人员已知的任意方法而转化为如本文中描述的任意盐, 优选药学上可接受的盐。类似地, 本发明的通式 (I) 的化合物的任意盐可以通过本领域技术人员已知的任意方法而转化为游离化合物。
- [1157] 本发明的通式 (I) 的化合物显示出有价值的药理学作用谱, 其无法预测。已出乎意料地发现, 本发明的化合物有效地与Sl_o-1相互作用, 并且因此所述化合物可能用于在人和动物中治疗或预防疾病, 优选蠕虫感染, 特别是胃肠和肠外蠕虫感染, 更特别是胃肠和肠外线虫感染。
- [1158] 本发明的化合物可以被用于控制, 治疗和/或预防蠕虫感染, 特别是胃肠和肠外蠕虫感染。该方法包括向需要其的哺乳动物施用对于治疗该病症而言有效的量的本发明的化合物, 或其药学上可接受的盐、异构体、多晶型物、代谢物、水合物、溶剂合物或酯。
- [1159] 在一个替代的方面中, 该方法包括向需要其的鸟, 即笼养鸟或者特别是家禽施用对于治疗该病症而言有效的量的本发明的化合物, 或其药学上可接受的盐、异构体、多晶型物、代谢物、水合物、溶剂合物或酯。
- [1160] 具体地, 在兽医药物领域中, 本发明的化合物适合于在温血动物中以有利的毒性来控制寄生虫, 特别是蠕虫, 其在家畜、育种、动物园、实验室、实验和家养动物中在动物育种和动物饲养中发生。它们对寄生虫, 特别是蠕虫发展的所有或具体阶段是有活性的。
- [1161] 农业家畜包括例如哺乳动物, 诸如绵羊、山羊、马、驴、骆驼、水牛、兔、驯鹿、黠鹿 (fallow deer) 和特别是牛和猪; 或者家禽, 诸如火鸡、鸭、鹅和特别是鸡; 或者鱼或甲壳类动物, 例如在水产业中。
- [1162] 家养动物包括例如哺乳动物, 诸如仓鼠、豚鼠、大鼠、小鼠、毛丝鼠、雪貂或者特别是狗、猫; 笼养鸟; 爬行动物; 两栖动物或观赏鱼。
- [1163] 本发明还提供治疗蠕虫感染, 特别是胃肠和肠外蠕虫感染, 更特别是胃肠和肠外线虫感染的方法。
- [1164] 这些病症已在动物中被很好地表征, 并且可以通过施用本发明的药物组合物而治疗。
- [1165] 如本文本中使用的术语“治疗 (treating 或 treatment)” 常规地使用, 例如以对抗、缓解、减少、减轻、改善疾病或病症 (例如线虫感染) 的状态为目的而管理或照顾个体。特别地, 并且特别是在动物健康或兽医领域, 术语“治疗” 包括预防的、补救性预防的 (metaphylactic) 或治疗学的治疗。
- [1166] 人或动物的蠕虫病原体包括例如棘头虫纲 (Acanthocephala)、线虫类、舌形虫属 (Pentastoma) 和扁形动物门 (Platyhelminthes) (例如单殖吸虫 (Monogenea)、绦虫 (Cestodes) 和吸虫 (trematodes))。
- [1167] 示例性的蠕虫包括但不限于:
- [1168] 单殖吸虫: 例如: 指环虫属 (Dactylogyrus spp.)、三代虫属 (Gyrodactylus spp.)、Microbothrium spp.、多盘吸虫属 (Polystoma spp.)、Trogglecephalus spp.。
- [1169] 绦虫: 来自假叶目 (Pseudophyllidea), 例如: 沟槽绦虫属 (Bothridium spp.)、裂头绦虫属 (Diphyllobothrium spp.)、复殖孔绦虫属 (Diplogonoporus spp.)、

Ichthyobothrium spp.、舌状绦虫属(*Ligula* spp.)、*Schistocephalus* spp.、迭宫绦虫属(*Spirometra* spp.)；

[1170] 来自圆叶目(*Cyclophyllidea*)，例如：*Andyra* spp.、裸头绦虫属(*Anoplocephala* spp.)、无卵黄腺绦虫属(*Avitellina* spp.)、伯特绦虫属(*Bertiella* spp.)、鸣绦虫属(*Cittotaenia* spp.)、*Davainea* spp.、双睾绦虫属(*Diorchis* spp.)、复孔绦虫属(*Diplopylidium* spp.)、犬复孔绦虫属(*Dipylidium* spp.)、棘球绦虫属(*Echinococcus* spp.)、棘叶绦虫属(*Echinocotyle* spp.)、棘鳞绦虫属(*Echinolepis* spp.)、泡尾绦虫属(*Hydatigera* spp.)、膜壳绦虫属(*Hymenolepis* spp.)、约优克斯绦虫属(*Joyeuxiella* spp.)、中殖孔绦虫属(*Mesocestoides* spp.)、莫尼茨绦虫属(*Moniezia* spp.)、副裸头绦虫属(*Paranoplocephala* spp.)、瑞利绦虫属(*Raillietina* spp.)、斯泰乐绦虫属(*Stilesia* spp.)、带绦虫属(*Taenia* spp.)、曲子宫绦虫属(*Thysaniezia* spp.)、縷状带绦虫属(*Thysanosoma* spp.)。

[1171] 吸虫：来自复殖亚纲(*Digenea*)类，例如：澳毕吸虫属(*Austroilharzia* spp.)、短咽吸虫属(*Brachylaima* spp.)、杯殖吸虫属(*Calicophoron* spp.)、下弯吸虫属(*Catatropis* spp.)、支睾吸虫属(*Clonorchis* spp.)、肛瘤吸虫属(*Collyriclum* spp.)、殖盘吸虫属(*Cotylophoron* spp.)、环腔吸虫属(*Cyclocoelum* spp.)、双腔吸虫属(*Dicrocoelium* spp.)、双穴吸虫属(*Diplostomum* spp.)、棘隙吸虫属(*Echinochasmus* spp.)、棘缘吸虫属(*Echinoparyphium* spp.)、棘口吸虫属(*Echinostoma* spp.)、阔盘吸虫属(*Eurytoma* spp.)、片形吸虫属(*Fasciola* spp.)、拟片形吸虫属(*Fascioloides* spp.)、姜片吸虫属(*Fasciolopsis* spp.)、菲策吸虫属(*Fiscoederius* spp.)、腹袋吸虫属(*Gastrothylacus* spp.)、巨毕吸虫属(*Gigantobilharzia* spp.)、*Gigantocotyle* spp.、异形吸虫属(*Heterophyes* spp.)、低颈吸虫属(*Hypoderaeum* spp.)、彩蚴吸虫属(*Leucochloridium* spp.)、后殖吸虫属(*Metagonimus* spp.)、次睾吸虫属(*Metorchis* spp.)、侏形吸虫属(*Nanophyetus* spp.)、背孔吸虫属(*Notocotylus* spp.)、后睾吸虫属(*Opisthorchis* spp.)、鸟毕吸虫属(*Ornithobilharzia* spp.)、并殖吸虫属(*Paragonimus* spp.)、同端盘吸虫属(*Paramphistomum* spp.)、斜睾吸虫属(*Plagiorchis* spp.)、茎双穴吸虫属(*Posthodiplostomum* spp.)、前殖吸虫属(*Prosthogonimus* spp.)、血吸虫属(*Schistosoma* spp.)、毛毕吸虫属(*Trichobilharzia* spp.)、蛙吸虫属(*Troglootrema* spp.)、盲腔吸虫属(*Typhlocoelum* spp.)。

[1172] 线虫：来自毛形目(*Trichinellida*)，例如：毛细线虫属(*Capillaria* spp.)、鞘属(*Eucoleus* spp.)、*Paracapillaria* spp.、旋毛虫属(*Trichinella* spp.)、*Trichomosoides* spp.、鞭虫属(*Trichuris* spp.)；

[1173] 来自垫刃目(*Tylenchida*)，例如：细丝线虫属(*Micronema* spp.)、*Parastrangyloides* spp.、类圆线虫属(*Strongyloides* spp.)；

[1174] 来自杆形亚目(*Rhabditina*)，例如：猫圆线虫属(*Aelurostrongylus* spp.)、裂口线虫属(*Amidostomum* spp.)、钩虫线虫属(*Ancylostoma* spp.)、血管圆线虫属(*Angiostrongylus* spp.)、*Bronchonema* spp.、仰口线虫属(*Bunostomum* spp.)、夏伯特线虫属(*Chabertia* spp.)、古柏线虫属(*Cooperia* spp.)、*Cooperioides* spp.、环体线虫属(*Crenosoma* spp.)、杯口属(*Cyathostomum* spp.)、*Cyclococercus* spp.、

Cyclodontostomum spp.、杯环属(Cylicocyclus spp.)、杯冠属(Cylicostephanus spp.)、柱咽属(Cylindropharynx spp.)、囊尾线虫属(Cystocaulus spp.)、网尾线虫属(Dictyocaulus spp.)、鹿圆线虫属(Elaphostrongylus spp.)、类丝虫属(Filaroides spp.)、球首属(Globocephalus spp.)、细纹线虫属(Graphidium spp.)、辐首线虫属(Gyalocephalus spp.)、血矛线虫属(Haemonchus spp.)、螺旋线虫属(Heligmosomoides spp.)、猪圆线虫属(Hyostrongylus spp.)、马歇尔线虫属(Marshallagia spp.)、后圆线虫属(Metastrongylus spp.)、缪勒线虫属(Muellerius spp.)、板口线虫属(Necator spp.)、细颈线虫属(Nematodirus spp.)、新圆线虫属(Neoststrongylus spp.)、日本圆线虫属(Nippostrongylus spp.)、尖柱线虫属(Obeliscoides spp.)、食道齿属(Oesophagodontus spp.)、食道口线虫属(Oesophagostomum spp.)、沃鲁线虫属(Ollulanus spp.)、鸟圆线虫属(Ornithostrongylus spp.)、Oslerus spp.、奥斯特线虫属(Ostertagia spp.)、Paracooperia spp.、Paracrenosoma spp.、副类丝虫属(Parafilaroides spp.)、拟马鹿圆线虫属(Parelaphostrongylus spp.)、肺尾属(Pneumocaulus spp.)、肺圆线虫属(Pneumostrongylus spp.)、杯口线虫属(Poteriostomum spp.)、原圆线虫属(Protostrongylus spp.)、Spicocaulus spp.、冠尾线虫属(Stephanurus spp.)、Strongylus spp.、比翼属(Syngamus spp.)、背带线虫属(Teladorsagia spp.)、毛线属(Trichonema spp.)、毛圆线虫属(Trichostrongylus spp.)、三齿属(Triodontophorus spp.)、隐圆线虫属(Troglostrongylus spp.)、弯口属(Uncinaria spp.)；

[1175] 来自旋尾目(Spirurida)，例如：棘唇线虫属(Acanthocheilonema spp.)、异尖线虫属(Anisakis spp.)、禽蛔虫属(Ascaridia spp.)、蛔虫属(Ascaris spp.)、斜环咽线虫属(Ascarops spp.)、无刺线虫属(Aspiculuris spp.)、贝利蛔线虫属(Baylisascaris spp.)、布鲁线虫属(Brugia spp.)、Cercopithifilaria spp.、Crassicauda spp.、棘唇线虫属(Dipetalonema spp.)、恶丝虫属(Dirofilaria spp.)、龙线虫属(Dracunculus spp.)、德拉西线虫属(Draschia spp.)、蛲虫属(Enterobius spp.)、丝虫属(Filaria spp.)、颚口线虫属(Gnathostoma spp.)、筒线虫属(Gongylonema spp.)、丽线虫属(Habronema spp.)、异刺线虫属(Heterakis spp.)；光丝虫属(Litomosoides spp.)、罗阿丝虫属(Loa spp.)、盘尾丝虫属(Onchocerca spp.)、尖尾线虫属(Oxyuris spp.)、副柔线虫属(Parabronema spp.)、副丝虫属(Parafilaria spp.)、副蛔虫属(Parascaris spp.)、栓尾线虫属(Passalurus spp.)、泡翼线虫属(Physaloptera spp.)、普氏线虫属(Probstmayria spp.)、Pseudofilaria spp.、腹腔丝虫属(Setaria spp.)、Skjrabinema spp.、尾旋线虫属(Spirocerca spp.)、冠丝虫属(Stephanofilaria spp.)、Strongyluris spp.、管状线虫属(Syphacia spp.)、吸吮线虫属(Thelazia spp.)、弓蛔线虫属(Toxascaris spp.)、弓蛔虫属(Toxocara spp.)、吴策线虫属(Wuchereria spp.)。

[1176] 棘头虫纲(Acanthocephala)：来自寡棘吻目(Oligacanthorhynchida)，例如：巨吻棘头虫属(Macracanthorhynchus spp.)、前睾棘头虫属(Prosthenorchis spp.)；来自Moniliformida目，例如：念珠棘虫属(Moniliformis spp.)；

[1177] 来自多形目(Polymorphida)，例如细颈棘头虫属(Filicollis spp.)；来自棘吻目(Echinorhynchida)，例如棘头虫属(Acanthocephalus)、棘吻虫属(Echinorhynchus spp.)、似细吻棘头虫属(Leptorhynchoides spp.)。

[1178] 舌形动物门 (Pentastoma) : 来自蛇舌状虫目 (Porocephalida), 例如舌形虫属 (Linguatula spp.)。

[1179] 本发明的化合物可以特别用于治疗 and 避免, 即预防, 蠕虫感染, 特别是胃肠和肠外蠕虫感染, 更特别是胃肠和肠外线虫感染。

[1180] 通过使用本发明的化合物来控制动物寄生虫, 特别是蠕虫, 意图减少或避免疾病、死亡案例和性能降低 (在肉、奶、毛、皮、蛋、蜂蜜等的情况下), 以使得能够进行更经济和更简单的动物饲养, 并且可以实现更好的动物福利。

[1181] 如本文中针对动物健康领域而使用的术语“控制 (control 或 controlling)”指本发明的化合物在将感染各寄生虫的动物中的这种寄生虫的发生率降低至无害水平方面是有效的。更具体地, 如本文中使用的“控制”指本发明的化合物在杀死各寄生虫、抑制其生长、或抑制其繁殖方面是有效的。

[1182] 根据一个进一步的方面, 本发明涵盖如上文所述的通式 (I) 的化合物, 或者它们的立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂合物和盐, 特别是它们的药学上可接受的盐, 或者其混合物, 其用于治疗或预防疾病, 特别是蠕虫感染, 特别是胃肠和肠外蠕虫感染, 更特别是胃肠和肠外线虫感染。

[1183] 根据本发明所述的化合物的药物活性可以通过其与Sl_o-1离子通道的相互作用而得到解释。

[1184] 根据一个进一步的方面, 本发明涵盖如上文所述的通式 (I) 的化合物, 或者它们的立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂合物和盐, 特别是他们的药学上可接受的盐, 或者其混合物用于治疗或预防疾病, 特别是蠕虫感染, 特别是胃肠和肠外蠕虫感染, 更特别是胃肠和肠外线虫感染的用途。

[1185] 根据一个进一步的方面, 本发明涵盖如上文所述的通式 (I) 的化合物, 或者它们的立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂合物和盐, 特别是它们的药学上可接受的盐, 或者其混合物在治疗或预防疾病, 特别是蠕虫感染, 特别是胃肠和肠外蠕虫感染, 更特别是胃肠和肠外线虫感染的方法中的用途。

[1186] 根据一个进一步的方面, 本发明涵盖如上文所述的通式 (I) 的化合物, 或者它们的立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂合物和盐, 特别是它们的药学上可接受的盐, 或者其混合物用于制备药物组合物 (优选药物) 的用途, 所述药物组合物用于治疗或预防疾病, 特别是蠕虫感染, 特别是胃肠和肠外蠕虫感染, 更特别是胃肠和肠外线虫感染。

[1187] 根据一个进一步的方面, 本发明涵盖治疗或预防疾病, 特别是蠕虫感染, 特别是胃肠和肠外蠕虫感染, 更特别是胃肠和肠外线虫感染的方法, 其使用有效量的如上文所述的通式 (I) 的化合物, 或者它们的立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂合物和盐, 特别是它们的药学上可接受的盐, 或者其混合物。

[1188] 根据一个进一步的方面, 本发明涵盖如上文所述的通式 (I) 的化合物, 或者它们的立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂合物和盐, 特别是它们的药学上可接受的盐, 或者其混合物, 其用作抗体内寄生虫剂。

[1189] 根据一个进一步的方面, 本发明涵盖如上文所述的通式 (I) 的化合物, 或者它们的立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂合物和盐, 特别是它们的药学上可接受的盐, 或者其混合物, 其用作抗蠕虫剂, 特别是用作杀线虫剂、杀扁形动物剂、杀棘头动物剂或

杀舌形动物剂。

[1190] 根据一个进一步的方面,本发明涵盖药物组合物,特别是兽医制剂,其包含如上文所述的通式(I)的化合物,或者它们的立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂合物、盐,特别是药学上可接受的盐,或者其混合物,以及一种或多种赋形剂,特别是一种或多种药学上可接受的赋形剂。可以利用用于以适合剂型制备这样的药物组合物的常规程序。

[1191] 根据一个进一步的方面,本发明涵盖用于制备药物组合物,特别是兽医制剂的方法,其包括将如上文所述的通式(I)的化合物,或者它们的立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂合物、盐,特别是药学上可接受的盐,或者其混合物与一种或多种赋形剂,特别是一种或多种药学上可接受的赋形剂进行混合的步骤。

[1192] 根据一个进一步的方面,本发明涵盖使用药物组合物特别是兽医制剂治疗或预防疾病,特别是蠕虫感染,特别是胃肠和肠外蠕虫感染,更特别是胃肠和肠外线虫感染的方法,所述药物组合物包含有效量的如上文所述的通式(I)的化合物,或者它们的立体异构体、互变异构体、N-氧化物、水合物、溶剂合物和盐,特别是它们的药学上可接受的盐,或者其混合物。

[1193] 本发明进一步涵盖药物组合物,特别是兽医制剂,其包含根据本发明所述的至少一种化合物,常规还有一种或多种药学上适合的赋形剂,以及它们用于上文所述目的用途。

[1194] 根据本发明所述的化合物可能具有全身和/或局部活性。为该目的,其可能以适合的方式施用,诸如,例如经由口服、肠胃外、肺、鼻、舌下、舌、颊、直肠、阴道、皮肤、经皮肤、结膜、耳途径或作为植入物或支架施用。这样的施用可以预防性、补救预防性或治疗性地实施。

[1195] 对于这些施用途径,根据本发明所述的化合物可能以适当的施用形式施用。

[1196] 对于口服施用,可能将根据本发明所述的化合物配制为迅速和/或以改性方式递送本发明化合物的本领域已知的剂型,诸如,例如片剂(未包衣或包衣片剂,例如具有延迟的溶解或不溶解的肠溶包衣或控释包衣)、口服崩解片剂、膜/薄片、膜/冻干物、胶囊(例如硬或软明胶胶囊)、糖衣片剂、颗粒剂、小丸剂、咀嚼片(例如软咀嚼片)、粉剂、乳剂、混悬剂、气雾剂或溶液。可能将根据本发明所述的化合物以结晶和/或无定形的和/或溶解的形式并入所述剂型中。

[1197] 肠胃外施用可以在避免吸收步骤(例如静脉内、动脉内、心内、脊柱内或腰内(intralumbar))或包括吸收(例如肌内、皮下、皮内、经皮或腹膜内)的情况下实现。适合于肠胃外施用的施用形式尤其是溶液、混悬剂、乳剂、冻干物或灭菌粉末的形式的注射和输注用制剂。

[1198] 适合于其它施用途径的实例是用于吸入的药物形式[尤其是粉末吸入剂、喷雾剂]、滴鼻剂、鼻用溶液、鼻喷雾;用于舌、舌下或颊施用的片剂/膜/薄片/胶囊;栓剂;滴眼剂、眼膏、洗眼杯、眼插入物、滴耳剂、耳喷雾、耳用粉剂、洗耳剂、耳填塞物;阴道胶囊、水混悬剂(洗剂、振荡混合物(mixturae agitandae))、亲脂混悬剂、乳剂、软膏、乳膏、经皮治疗系统(诸如,例如贴剂)、乳、糊剂、泡沫、点涂剂(spot-on)、撒布剂、植入物或支架。

[1199] 根据本发明所述的化合物可以被并入所述施用形式中。这可能以本身已知的方式通过与药学上适合的赋形剂混合而实现。药学上适合的赋形剂尤其包括:

- [1200] ● 填料和载体 (例如纤维素、微晶纤维素 (诸如,例如Avicel[®])、乳糖、甘露醇、淀粉、磷酸钙 (诸如,例如Di-Cafos[®]));
- [1201] ● 软膏基质 (例如凡士林、石蜡、甘油三酯、蜡、羊毛蜡、羊毛蜡醇、羊毛脂、亲水性软膏、聚乙二醇);
- [1202] ● 栓剂基质 (例如聚乙二醇、可可脂、硬脂);
- [1203] ● 溶剂 (例如水、乙醇、异丙醇、甘油、丙二醇、中链甘油三酯脂肪油、液体聚乙二醇、石蜡);
- [1204] ● 表面活性剂、乳化剂、分散剂或润湿剂 (例如十二烷基硫酸钠)、卵磷脂、磷脂、脂肪醇 (诸如,例如Lanette[®])、脱水山梨糖醇脂肪酸酯 (诸如,例如Span[®])、聚氧乙烯脱水山梨糖醇脂肪酸酯 (诸如,例如Tween[®])、聚氧乙烯脂肪酸甘油酯 (诸如,例如Cremophor[®])、聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚、甘油脂肪酸酯、泊洛沙姆 (诸如,例如Pluronic[®]);
- [1205] ● 缓冲剂、酸和碱 (例如磷酸盐、碳酸盐、柠檬酸、乙酸、盐酸、氢氧化钠溶液、碳酸铵、氨丁三醇、三乙醇胺);
- [1206] ● 等渗剂 (例如葡萄糖、氯化钠);
- [1207] ● 吸附剂 (例如高分散二氧化硅);
- [1208] ● 增粘剂、凝胶形成剂、增稠剂和/或粘合剂 (例如聚乙烯吡咯烷酮、甲基纤维素、羟丙基甲基纤维素、羟丙基纤维素、羧甲基纤维素钠、淀粉、卡波姆、聚丙烯酸 (诸如,例如Carbopol[®]);藻酸盐、明胶);
- [1209] ● 崩解剂 (例如改性淀粉、羧甲基纤维素钠、淀粉乙醇酸钠 (诸如,例如Explotab[®])、交联聚乙烯吡咯烷酮、交联羧甲基纤维素钠 (诸如,例如AcDiSol[®]));
- [1210] ● 流动调节剂、润滑剂、助流剂和脱模剂 (例如硬脂酸镁、硬脂酸、滑石、高分散二氧化硅 (诸如,例如Aerosil[®]));
- [1211] ● 包衣材料 (例如糖、虫胶) 和用于快速溶解或以改性方式溶解的膜或扩散膜的成膜剂 (例如聚乙烯吡咯烷酮 (诸如,例如Kollidon[®])、聚乙烯醇、羟丙基甲基纤维素、羟丙基纤维素、乙基纤维素、羟丙基甲基纤维素邻苯二甲酸酯、乙酸纤维素、邻苯二甲酸乙酸纤维素、聚丙烯酸酯、聚甲基丙烯酸酯 (诸如,例如Eudragit[®]));
- [1212] ● 胶囊材料 (例如明胶、羟丙基甲基纤维素);
- [1213] ● 合成聚合物 (例如聚丙交酯、聚乙交酯、聚丙烯酸酯、聚甲基丙烯酸酯 (诸如,例如Eudragit[®])、聚乙烯吡咯烷酮 (诸如,例如Kollidon[®])、聚乙烯醇、聚乙酸乙烯酯、聚环氧乙烷、聚乙二醇以及它们的共聚物和嵌段共聚物);
- [1214] ● 增塑剂 (例如聚乙二醇、丙二醇、甘油、三醋精、三乙酰基柠檬酸酯、邻苯二甲酸二丁酯);
- [1215] ● 渗透促进剂;
- [1216] ● 稳定剂 (例如抗氧化剂,诸如,例如抗坏血酸、抗坏血酸棕榈酸酯、抗坏血酸钠、丁基羟基苯甲醚、丁基羟基甲苯、没食子酸丙酯);
- [1217] ● 防腐剂 (例如尼泊金、山梨酸、硫柳汞、苯扎氯铵、乙酸氯己定、苯甲酸钠);
- [1218] ● 着色剂 (例如无机颜料,诸如,例如氧化铁、二氧化钛);
- [1219] ● 矫味剂、甜味剂、味道和/或气味掩蔽剂。
- [1220] 本发明进一步涉及药物组合物,其包含至少一种根据本发明所述的化合物、常规

还有一种或多种药学上适合的赋形剂,以及它们根据本发明的用途。

[1221] 根据另一个方面,本发明涵盖药物组合(pharmaceutical combination),特别是药物,其包含至少一种本发明的通式(I)的化合物和至少一种或多种另外的活性成分,其特别用于治疗 and/或预防体内和/或体外寄生虫感染。

[1222] 本发明中的术语“体内寄生虫”如本领域技术人员已知那样使用,并且特别指蠕虫。本发明中的术语“体外寄生虫”如本领域技术人员已知那样使用,并且特别指节肢动物,特别是昆虫或螨。

[1223] 特别地,本发明涵盖药物组合,特别是兽医组合,其包含:

[1224] ● 一种或多种第一活性成分,特别是如上文所定义的通式(I)的化合物;和

[1225] ● 一种或多种另外的活性成分,特别是一种或多种杀体内和/或体外寄生虫剂。

[1226] 本发明中的术语“组合”如本领域技术人员已知那样使用,所述组合可能为固定组合、非固定组合,或套装药盒(kit-of-parts)。

[1227] 本发明中的“固定组合”如本领域技术人员已知那样使用,并且被定义为下述组合,其中,例如第一活性成分,诸如一种或多种本发明的通式(I)的化合物,和另一种活性成分一起存在于一个单位剂量中或者存在于一个单一实体中。“固定组合”的一个实例是下述药物组合物,其中第一活性成分和另外的活性成分存在于用于同时施用的掺混物中,例如制剂中。“固定组合”的另一个实例是下述药物组合,其中第一活性成分和另外的活性成分存在于一个单位中但不是掺混物中。

[1228] 本发明的非固定组合或“套装药盒”如本领域技术人员已知那样使用,并且被定义为下述组合,其中第一活性成分和另外的活性成分存在于多于一个单位中。非固定组合或套装药盒的一个实例是下述组合,其中第一活性成分和另外的活性成分分开存在。非固定组合或套装药盒的组分可能分别、接续、同时、同步或按时间顺序交叉施用。

[1229] 本发明的化合物可能以单一药剂或以与一种或多种其它的药学活性成分的组合(其中,组合不引起不可接受的副作用)形式施用。本发明还涵盖这样的药物组合。例如,本发明的化合物可以与已知的杀体外寄生虫剂和/或杀体内寄生虫剂合并。

[1230] 本文中以其通用名指出的其它或另外的活性成分是已知的,并且被描述于例如杀虫剂手册(“The Pesticide Manual”第16版,British Crop Protection Council 2012),或可以在互联网中检索(例如 <http://www.alanwood.net/pesticides>)。分类基于在提交本专利申请时现行的IRAC作用机制分类表。

[1231] 杀体外寄生虫剂和/或杀体内寄生虫剂的实例是杀昆虫剂、杀螨剂和杀线虫剂,并且特别包括:

[1232] (1) 乙酰胆碱酯酶(AChE)抑制剂,诸如,例如氨基甲酸酯,例如棉铃威(alanycarb)、涕灭威(aldicarb)、噁虫威(bendiocarb)、丙硫克百威(benfuracarb)、丁酮威(butoxycarboxim)、丁酮砜威(butoxycarboxim)、甲萘威(carbaryl)、克百威(carbofuran)、丁硫克百威(carbosulfan)、乙硫苯威(ethiofencarb)、仲丁威(fenobucarb)、伐虫脒(formetanate)、呋线威(furathiocarb)、异丙威(isoprocarb)、甲硫威(methiocarb)、灭多虫(methomyl)、速灭威(metolcarb)、杀线威(oxamyl)、抗蚜威(pirimicarb)、残杀威(propoxur)、硫双威(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、啮蚜威(triazamate)、混杀威(trimethacarb)、XMC和灭杀威(xylylcarb);或者有机磷酸酯,例如

乙酰甲胺磷(acephate)、甲基吡恶磷(azamethiphos)、乙基谷硫磷(azinphos-ethyl)、甲基谷硫磷(azinphos-methyl)、硫线磷(cadusafos)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒虫畏(chlorfenvinphos)、氯甲硫磷(chlormephos)、甲基毒死蜱(chlorpyrifos-methyl)、蝇毒磷(coumaphos)、杀螟腈(cyanophos)、甲基内吸磷(demeton-S-methyl)、二嗪农(diazinon)、敌敌畏/DDVP(dichlorvos/DDVP)、百治磷(dicrotophos)、乐果(dimethoate)、甲基毒虫畏(dimethylvinphos)、乙拌磷(disulphoton)、EPN、乙硫磷(ethion)、灭线磷(ethoprophos)、伐灭磷(famphur)、苯线磷(fenamiphos)、杀螟硫磷(fenitrothion)、倍硫磷(fenthion)、噻唑磷(fosthiazate)、庚烯磷(heptenophos)、新烟磷(imicyafos)、异柳磷(isofenphos)、0-(甲氧基氨基硫代磷酰基)水杨酸异丙酯(isopropyl 0-(methoxyaminothio-phosphoryl) salicylate)、异噁唑磷(isoxathion)、马拉硫磷(malathion)、灭蚜磷(mecarbam)、甲胺磷(methamidophos)、杀扑磷(methidathion)、速灭磷(mevinphos)、久效磷(monocrotophos)、二溴磷(naled)、氧乐果(omethoate)、亚砷磷(oxydemeton-methyl)、甲基对硫磷(parathion-methyl)、稻丰散(phenthoate)、甲拌磷(phorate)、伏杀磷(phosalone)、亚胺硫磷(phosmet)、磷胺(phosphamidon)、胐硫磷(phoxim)、甲基嘧啶磷(pirimiphos-methyl)、丙溴磷(profenofos)、胺丙畏(propetamphos)、丙硫磷(prothiofos)、吡唑硫磷(pyraclufos)、哒嗪硫磷(pyridaphenthion)、喹硫磷(quinalphos)、治螟磷(sulfotep)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、替美磷(temephos)、特丁磷(terbufos)、司替罗磷(tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷(thiometon)、三唑磷(triazophos)、敌百虫(triclorfon)和蚜灭磷(vamidothion)。

[1233] (2) GABA-门控氯离子通道阻断剂, 诸如, 例如环二烯有机氯类, 例如氯丹(chlordane)和硫丹(endosulfan); 或者苯基吡唑(phenylpyrazoles(fiproles)), 例如乙虫腈(ethiprole)和氟虫腈(fipronil)。

[1234] (3) 钠通道调节剂, 诸如, 例如拟除虫菊酯类(pyrethroids), 例如氟丙菊酯(acrinathrin)、烯丙菊酯(allethrin)、d-顺-反烯丙菊酯(d-cis-trans allethrin)、d-反烯丙菊酯(d-trans allethrin)、联苯菊酯(bifenthrin)、生物烯丙菊酯(bioallethrin)、生物烯丙菊酯S-环戊烯基异构体、生物苄呋菊酯(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、氟氯氰菊酯(cyfluthrin)、 β -氟氯氰菊酯、氯氟氰菊酯(cyhalothrin)、 λ -氯氟氰菊酯、 γ -氯氟氰菊酯、氯氰菊酯(cypermethrin)、 α -氯氰菊酯、 β -氯氰菊酯、 θ -氯氰菊酯、 ζ -氯氰菊酯、苯醚氰菊酯[(1R)-反式异构体](cyphenothrin[(1R)-trans-isomers])、溴氰菊酯(deltamethrin)、右旋烯炔菊酯[(EZ)-(1R)异构体](empenthrin[(EZ)-(1R)-isomers])、高氰戊菊酯(esfenvalerate)、醚菊酯(etofenprox)、甲氰菊酯(fenpropathrin)、氰戊菊酯(fenvalerate)、氟氰戊菊酯(flucythrinate)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、 τ -氟胺氰菊酯(tau-fluvalinate)、苄呋醚(halfenprox)、咪炔菊酯(imiprothrin)、噻恩菊酯(kadethrin)、momfluorothrin、氯菊酯(permethrin)、苯醚菊酯[(1R)-反式异构体](phenothrin[(1R)-trans-isomer])、炔丙菊酯(prallethrin)、除虫菊酯(pyrethrine)(除虫菊(pyrethrum))、苄呋菊酯(resmethrin)、氟硅菊酯(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、胺菊酯、胺菊酯[(1R)异构体](tetramethrin[(1R) isomer])、四溴菊酯(tralomethrin)和四氟苯菊酯(transfluthrin), 或DDT或甲氧氯

(methoxychlor)。

[1235] (4) 烟酸乙酰胆碱受体 (nAChR) 竞争性调节剂, 诸如, 例如新烟碱类 (neonicotinoids), 例如啮虫脒 (acetamiprid)、噻虫胺 (clothianidin)、呋虫胺 (dinotefuran)、吡虫啉 (imidacloprid)、烯啶虫胺 (nitenpyram)、噻虫啉 (thiacloprid) 和噻虫嗪 (thiamethoxam) 或者尼古丁或氟啮虫胺腈 (sulfoxaflor) 或氟吡呋喃酮 (flupyradifurone)。

[1236] (5) 烟酸乙酰胆碱受体 (nAChR) 变构调节剂, 诸如, 例如多杀菌素类 (spinosyns), 例如乙基多杀菌素 (spinetoram) 和多杀菌素 (spinosad)。

[1237] (6) 谷氨酸门控氯离子通道 (GluCl) 变构调节剂, 诸如, 例如阿维菌素类/米尔倍霉素类 (avermectins/milbemycins), 例如阿维菌素 (abamectin)、埃玛菌素 (emamectin benzoate)、雷皮菌素 (lepimectin) 和弥拜菌素 (milbemectin)。

[1238] (7) 保幼激素模仿物, 诸如, 例如保幼激素类似物, 例如烯虫乙酯 (hydroprene)、烯虫炔酯 (kinoprene) 和烯虫酯 (methoprene), 或者苯氧威 (fenoxycarb) 或蚊蝇醚 (pyriproxyfen)。

[1239] (9) 弦音器官的调节剂, 诸如, 例如吡蚜酮 (pymetrozine) 或氟啮虫酰胺 (flonicamid)。

[1240] (10) 螨生长抑制剂, 诸如, 例如四螨嗪 (clofentezine)、噻螨酮 (hexythiazox) 和氟螨嗪 (diflovidazin) 或乙螨唑 (etoxazole)。

[1241] (12) 线粒体 ATP 合成酶的抑制剂, 诸如 ATP 干扰剂, 诸如, 例如丁醚脲 (diafenthiuron) 或有机锡化合物, 例如三唑锡 (azocyclotin)、三环锡 (cyhexatin) 和苯丁锡 (fenbutatin oxide), 或者克螨特 (propargite) 或四氯杀螨砜 (tetradifon)。

[1242] (13) 经由破坏质子梯度的氧化磷酸化解偶联剂, 诸如, 例如虫螨腈 (chlorfenapyr)、DNOC 和氟虫胺 (sulfluramid)。

[1243] (14) 烟酸乙酰胆碱受体通道阻断剂, 诸如, 例如杀虫磺 (bensultap)、杀螟丹盐酸盐 (cartap hydrochloride)、杀虫环 (thiocyclam) 和杀虫双 (thiosultap-sodium)。

[1244] (15) 0型几丁质生物合成抑制剂, 诸如, 例如双三氟虫脲 (bistrifluron)、定虫隆 (chlofluazuron)、二氟脲 (diflubenzuron)、氟环脲 (flucyclozuron)、氟虫脲 (flufenoxuron)、氟铃脲 (hexaflumuron)、氯芬奴隆 (lufenuron)、双苯氟脲 (novaluron)、多氟脲 (noviflumuron)、氟苯脲 (teflubenzuron) 和杀铃脲 (triflumuron)。

[1245] (16) 1型几丁质生物合成抑制剂, 例如噻嗪酮 (buprofezin)。

[1246] (17) 蜕皮干扰剂 (尤其对于双翅目, 即双翅类), 诸如, 例如灭蝇胺 (cyromazine)。

[1247] (18) 蜕皮激素受体激动剂, 诸如, 例如环虫酰肼 (chromafenozide)、氯虫酰肼 (halofenozide)、甲氧虫酰肼 (methoxyfenozide) 和虫酰肼 (tebufenozide)。

[1248] (19) 章鱼胺受体激动剂, 诸如, 例如双甲脒 (amitraz)。

[1249] (20) 线粒体复合物 III 电子传递抑制剂, 诸如, 例如氟蚁腓 (hydramethylnone), 或灭螨醌 (acequinocyl) 或啞螨酯 (fluacrypyrim)。

[1250] (21) 线粒体复合物 I 电子传递抑制剂, 诸如, 例如来自 METI 杀螨剂的组, 例如啞螨醚 (fenazaquin)、啞螨酯 (fenpyroximate)、啞螨醚 (pyrimidifen)、啞螨灵 (pyridaben)、吡螨胺 (tebufenpyrad) 和啞虫酰胺 (tolfenpyrad) 或鱼藤酮 (rotenone) (鱼藤)。

[1251] (22) 电压依赖的钠通道阻断剂, 诸如, 例如茛虫威 (indoxacarb) 或氰氟虫脎 (metaflumizone)。

[1252] (23) 乙酰基-CoA羧化酶的抑制剂, 诸如, 例如季酮酸 (tetronic acid) 和特特拉姆酸 (tetramic acid) 衍生物, 例如螺螨酯 (spirodiclofen)、螺甲螨酯 (spiromesifen) 和螺虫乙酯 (spirotetramat)。

[1253] (25) 线粒体复合物II电子传递抑制剂, 诸如, 例如 β -酮腈衍生物, 例如腈吡螨酯 (cyenopyrafen) 和丁氟螨酯 (cyflumetofen); 和甲酰苯胺类, 诸如, 例如pyflubumide。

[1254] (28) 兰尼碱 (Ryanodine) 受体调节剂, 诸如, 例如二酰胺类, 例如氯虫苯甲酰胺 (chlorantraniliprole)、溴氰虫酰胺 (cyantraniliprole) 和氟虫双酰胺 (flubendiamide),

[1255] 另外的活性成分, 诸如, 例如Afidopyropen、阿福拉纳 (Afoxolaner)、印楝素 (Azadirachtin)、Benclorhiaz、苯螨特 (Benzoximate)、联苯肼酯 (Bifenazate)、Broflanilide、溴螨酯 (Bromopropylate)、灭螨猛 (Chinomethionat)、右旋反式氯丙炔菊酯 (Chloroprallethrin)、冰晶石 (Cryolite)、环溴虫酰胺 (Cyclaniliprole)、环氧虫啉 (Cycloxaprid)、氯氟氰虫酰胺 (Cyhalodiamide)、Dicloromezotiaz、三氯杀螨醇 (Dicofol)、 ϵ -甲氧苄氟菊酯 (epsilon-Metofluthrin)、epsilon-Momfluthrin、Flometoquin、Fluazaindolizine、Fluensulfone、啞虫胺 (Flufenimer)、氟菌螨酯 (Flufenoxystrobin)、丁虫腈 (Flufiprole)、Fluhexafon、氟吡菌酰胺 (Fluopyram)、氟雷拉纳 (Fluralaner)、Fluxametamide、呋喃虫酰胺 (Fufenozide)、戊吡虫脒 (Guadipyr)、Heptafluthrin、氯噻啉 (Imidaclothiz)、异菌脲 (Iprodione)、 κ -联苯菊酯 (kappa-Bifenthrin)、 κ -七氟菊酯 (kappa-Tefluthrin)、洛替拉纳 (Lotilaner)、氯氟醚菊酯 (Meperfluthrin)、啞虫啉 (Paichongding)、三氟甲吡啶 (Pyridalyl)、Pyrifluquinazon、啞螨胺 (Pyriminostrobin)、Spirobudiclofen、四氟醚菊酯 (Tetramethylfluthrin)、Tetraniliprole、四氯虫酰胺 (Tetrachlorantraniliprole)、Tioxazafen、硫氟脒醚 (Thiofluoximate)、Triflumezopyrim和碘甲烷 (iodomethane); 以及基于坚强芽孢杆菌 (*Bacillus firmus*, I-1582, BioNeem, Votivo) 的制剂; 以及还有下述化合物: 1-{2-氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亚磺酰基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三唑-5-胺 (获知于W02006/043635) (CAS 885026-50-6)、{1'-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基} (2-氯吡啶-4-基) 甲酮 (获知于W02003/106457) (CAS 637360-23-7)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-(4-氯苯基)丙-2-烯-1-基]哌啶-4-基}-4-(三氟甲基)苯基]异烟酰胺 (获知于W02006/003494) (CAS 872999-66-1)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮 (获知于W0 2010052161) (CAS 1225292-17-0)、碳酸3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙酯 (获知于EP2647626) (CAS 1440516-42-6)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶 (获知于W02004/099160) (CAS 792914-58-0)、PF1364 (获知于JP2010/018586) (CAS 1204776-60-2)、N-[(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)甲基]吡啶-2(1H)-亚基]-2,2,2-三氟乙酰胺 (获知于W02012/029672) (CAS 1363400-41-2)、(3E)-3-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-亚吡啶基]-1,1,1-三氟-丙-2-酮 (获知于W02013/144213) (CAS 1461743-15-6)、N-[3-(苄基氨基甲酰基)-4-氯苯基]-1-甲基-3-(五氟乙基)-4-(三

氟甲基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(获知于W02010/051926)(CAS 1226889-14-0)、5-溴-4-氯-N-[4-氯-2-甲基-6-(甲基氨基甲酰基)苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)吡唑-3-甲酰胺(获知于CN103232431)(CAS 1449220-44-3)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-甲基-N-(顺式-1-氧化-3-硫杂环丁烷基)-苯甲酰胺、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-甲基-N-(反式-1-氧化-3-硫杂环丁烷基)-苯甲酰胺和4-[(5S)-5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氢-5-(三氟甲基)-3-异噁唑基]-2-甲基-N-(顺式-1-氧化-3-硫杂环丁烷基)苯甲酰胺(获知于W0 2013/050317 A1)(CAS 1332628-83-7)、N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亚磺酰基]-丙酰胺、(+)-N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亚磺酰基]-丙酰胺和(-)-N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亚磺酰基]-丙酰胺(获知于W0 2013/162715 A2、W0 2013/162716 A2、US 2014/0213448 A1)(CAS 1477923-37-7)、5-[[(2E)-3-氯-2-丙烯-1-基]氨基]-1-[2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基]-4-[(三氟甲基)亚磺酰基]-1H-吡唑-3-甲腈(获知于CN 101337937 A)(CAS 1105672-77-2)、3-溴-N-[4-氯-2-甲基-6-(甲基氨基)硫代甲基]苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲酰胺、(硫代苯甲酰胺(Liudaibenjiaxuanan),获知于CN 103109816 A)(CAS 1232543-85-9);N-[4-氯-2-[[(1,1-二甲基乙基)氨基]羰基]-6-甲基苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(氟甲氧基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(获知于W0 2012/034403 A1)(CAS 1268277-22-0)、N-[2-(5-氨基-1,3,4-噁二唑-2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(获知于W0 2011/085575 A1)(CAS 1233882-22-8)、4-[3-[2,6-二氯-4-[(3,3-二氯-2-丙烯-1-基)氧基]苯氧基]丙氧基]-2-甲氧基-6-(三氟甲基)-嘧啶(获知于CN 101337940 A)(CAS 1108184-52-6);(2E)-和2(Z)-2-[2-(4-氰基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亚乙基]-N-[4-(二氟甲氧基)苯基]-肼甲酰胺(获知于CN 101715774 A)(CAS 1232543-85-9);3-(2,2-二氯乙基)-2,2-二甲基-4-(1H-苯并咪唑-2-基)苯基-环丙烷甲酸酯(获知于CN 103524422 A)(CAS 1542271-46-4);(4aS)-7-氯-2,5-二氢-2-[[(甲氧基羰基)[4-[(三氟甲基)硫基]苯基]氨基]羰基]-茚并[1,2-e][1,3,4]噁二嗪-4a(3H)-甲酸甲酯(获知于CN 102391261 A)(CAS 1370358-69-2);6-脱氧-3-O-乙基-2,4-二-O-甲基-、1-[N-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-五氟乙氧基)苯基]-1H-1,2,4-三唑-3-基]苯基]氨基甲酸酯]- α -L-吡喃甘露糖(获知于US 2014/0275503 A1)(CAS 1181213-14-8);8-(2-环丙基甲氧基-4-三氟甲基-苯氧基)-3-(6-三氟甲基-哒嗪-3-基)-3-氮杂-双环[3.2.1]辛烷(CAS 1253850-56-4)、(8-反)-8-(2-环丙基甲氧基-4-三氟甲基-苯氧基)-3-(6-三氟甲基-哒嗪-3-基)-3-氮杂-双环[3.2.1]辛烷(CAS 933798-27-7)、(8-顺)-8-(2-环丙基甲氧基-4-三氟甲基-苯氧基)-3-(6-三氟甲基-哒嗪-3-基)-3-氮杂-双环[3.2.1]辛烷(获知于W0 2007040280 A1、W0 2007040282 A1)(CAS 934001-66-8)、N-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1H-吡唑-4-基]-N-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)硫基]-丙酰胺(获知于W0 2015/058021 A1、W0 2015/058028 A1)(CAS 1477919-27-9)、N-[4-(氨基硫代甲基)-2-甲基-6-[(甲基氨基)羰基]苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1H-吡唑-5-甲酰胺(获知于CN 103265527 A)(CAS 1452877-50-7)、5-(1,3-二氧杂环己烷-2-基)-4-[[4-(三氟甲基)苯基]甲氧基]-嘧啶(获知于W0 2013/115391 A1)(CAS 1449021-97-9)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-4-羟基-8-甲氧基-1-甲基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(获知于W0 2010/

066780 A1、WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-34-0)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-1-甲基-1,8-二氮杂螺[4.5]癸烷-2,4-二酮 (获知于WO 2014/187846 A1) (CAS 1638765-58-8)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-1-甲基-2-氧代-1,8-二氮杂螺[4.5]癸-3-烯-4-基-甲酸乙酯 (获知于WO 2010/066780 A1、WO 2011/151146 A1) (CAS 1229023-00-0)、N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2(1H)-吡啶亚基]-2,2,2-三氟-乙酰胺 (获知于DE 3639877 A1、WO 2012029672 A1) (CAS 1363400-41-2)、[N(E)]-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2(1H)-吡啶亚基]-2,2,2-三氟-乙酰胺 (获知于WO 2016005276 A1) (CAS 1689566-03-7)、[N(Z)]-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2(1H)-吡啶亚基]-2,2,2-三氟-乙酰胺、(CAS 1702305-40-5)、3-丙-3-[2-丙氧基-4-(三氟甲基)苯氧基]-9-[[5-(三氟甲基)-2-吡啶基]氧基]-9-氮杂双环[3.3.1]壬烷 (获知于WO 2011/105506 A1、WO 2016/133011 A1) (CAS 1332838-17-1)。

[1256] 其它具有未知或非特异性的作用机制的活性成分,如氟硝二苯胺(fentrifanil)、非诺克林(fenoxacrim)、cycloprene、乙酯杀螨醇(chlorobenzilate)、杀虫脒(chlordimeform)、氟螨噻(flubenzimine)、地昔尼尔(dicyclanil)、磺胺螨酯(amidoflumet)、灭螨猛(quinomethionate)、苯螨噻(triarathene)、clothiazoben、杀螨好(tetrasul)、油酸钾(potassium oleate)、石油(petroleum)、恶虫酮(metoxadiazone)、红铃虫性诱剂(gossyplure)、氟螨嗪(flutenzin)、溴螨酯(brompropylate)、冰晶石(cryolite);

[1257] 其它种类的活性成分,例如畜虫威(butacarb)、敌蝇威(dimetilan)、除线威(cloethocarb)、磷虫威(phosphocarb)、嘧啶磷(pirimiphos(-ethyl))、对硫磷(parathion(-ethyl))、虫螨畏(methacrifos)、水杨酸异丙酯(isopropyl o-salicylate)、三氯磷酸酯(trichlorfon)、硫丙磷(sulprofos)、丙虫磷(propaphos)、克线丹(sebufos)、吡硫磷(pyridathion)、发硫磷(prothoate)、除线磷(dichlofenthion)、甲基砒内吸磷(demeton-S-methyl sulfone)、氯唑磷(isazofos)、苯腈磷(cyanofenphos)、氯亚胺硫磷(dialifos)、三硫磷(carbophenothion)、autathiofos、aromfenvinfos(-methyl)、益棉磷(azinphos(-ethyl))、毒死蜱(chlorpyrifos(-ethyl))、丁苯硫磷(fosmethilan)、碘硫磷(iodofenphos)、蔬果磷(dioxabenzofos)、安果(formothion)、地虫磷(fonofos)、吡氟硫磷(flupyrzofos)、丰索磷(fensulfiothion)、乙嘧硫磷(etrifos);

[1258] 有机氯类,例如毒杀芬(camphchlor)、林丹(lindane)、七氯(heptachlor);或苯基吡啶类,例如乙酰虫腈(acetoprole)、吡啶氟虫腈(pyrafluprole)、吡啶氟虫腈(pyriprole)、甲烯氟虫腈(vaniliprole)、维吉霉素(sisapronil);或异噁唑啉类,例如萨欧拉纳(sarolaner)、阿福拉纳(afoxolaner)、洛替拉纳(lotilaner)、氟雷拉纳(fluralaner);

[1259] 拟除虫菊酯类(pyrethroids),例如(顺式-、反式-)甲氧苄氟菊酯(metofluthrin)、丙氟菊酯(profluthrin)、三氟醚菊酯(flufenprox)、溴氟菊酯(flubrocylthrin)、fubfenprox、芬氟司林(fenfluthrin)、protrifenbute、反灭虫菊(pyresmethrin)、RU15525、环戊烯丙菊酯(terallethrin)、顺式-苄呋菊酯(cis-resmethrin)、heptafluthrin、戊环苄呋菊酯(bioethanomethrin)、生物氯菊酯(biopermethrin)、吡氯氰菊酯(fenpyrithrin)、顺式-氯氰菊酯(cis-cypermethrin)、顺

式-氯菊酯 (cis-permethrin)、功夫菊酯 (clopythrin)、高效氯氟氰菊酯 (cyhalothrin (lambda-))、二氯炔戊菊酯 (chlovaporthrin) 或卤代烃化合物 (HCHs)

[1260] 新烟碱类 (neonicotinoids), 例如硝虫噻唑 (nithiazine);

[1261] dicloromezotiaz、三氟苯嘧啶 (triflumezopyrim);

[1262] 大环内酯类 (macrocyclic lactones), 例如奈马克丁 (nemadectin)、伊维菌素 (ivermectin)、拉替菌素 (latidectin)、莫昔克丁 (moxidectin)、司拉克丁 (selamectin)、依立诺克丁 (eprinomectin)、多拉克丁 (doramectin)、埃玛菌素 (emamectin benzoate); 米尔贝肟 (milbemycin oxime);

[1263] 烯虫硫酯 (triprene)、保幼醚 (epofenonane)、苯虫醚 (diofenolan);

[1264] 生物制剂、激素或信息素, 例如天然产物, 例如苏云金素 (thuringiensin)、十二碳二烯醇 (codlemone) 或印楝 (neem) 成分;

[1265] 二硝基酚类, 例如敌螨普 (dinocap)、消螨通 (dinobuton)、乐杀螨 (binapacryl);

[1266] 苯甲酰基脲类, 例如氟佐隆 (fluazuron)、氟幼脲 (penfluron);

[1267] 脘衍生物, 例如chlormebuform、螨唑胺 (cymiazole)、得米地曲 (demiditraz);

[1268] 蜂螨属杀螨剂 (beehive varroa acaricides), 例如有机酸, 如甲酸、草酸。

[1269] 特别关注用于动物健康的杀昆虫剂和杀螨剂的非限制性实例是且特别包括 [即 Mehlhorn 等人, Encyclpaedic Reference of Parasitology 第四版 (ISBN 978-3-662-43978-4)]:

[1270] 节肢动物配体门控氯离子通道的效应物: 氯丹 (chlordane)、七氯 (heptachlor)、endoculfan、狄氏剂 (Dieldrin)、溴西克林 (bromocyclen)、毒杀芬 (toxaphene)、林丹 (lindane)、氟虫腈 (fipronil)、吡啶氟虫腈 (pyriprole)、维吉霉素 (sisapronil)、阿福拉纳 (afoxolaner)、氟雷拉纳 (fluralaner)、萨欧拉纳 (sarolaner)、洛替拉纳 (lotilaner)、fluxametamide、broflanilide、阿维菌素 (avermectin)、多拉克丁 (doramectin)、依立诺克丁 (eprinomectin)、伊维菌素 (ivermectin)、米尔倍霉素 (milbemycin)、莫昔克丁 (moxidectin)、司拉克丁 (selamectin);

[1271] 节肢动物章鱼胺能受体调节剂: 双甲脘 (amitraz)、BTS27271、螨唑胺 (cymiazole)、得米地曲 (demiditraz);

[1272] 节肢动物电压门控钠通道的效应物: DDT、甲氧氯 (methoxychlor)、氰氟虫腈 (metaflumizone)、茚虫威 (indoxacarb)、瓜菊酯I、瓜菊酯II、茚酮菊素I、茚酮菊素II、除虫菊酯I、除虫菊酯II、烯丙菊酯 (allethrin)、 α -氯氰菊酯 (alpha-cypermethrin)、生物烯丙菊酯 (bioallethrin)、 β -氟氯氰菊酯 (beta-cyfluthrin)、氟氯氰菊酯 (cyfluthrin)、氯氟氰菊酯 (cyhalothrin)、氯氰菊酯 (cypermethrin)、溴氰菊酯 (deltamethrin)、醚菊酯 (etofenprox)、氰戊菊酯 (fenvalerate)、氟氰戊菊酯 (flucythrinate)、氟氯苯菊酯 (flumethrin)、苜蓿醚 (halfenprox)、氯菊酯 (permethrin)、苯醚菊酯 (phenothrin)、苜蓿菊酯 (resmethrin)、 τ -氟胺氰菊酯 (tau-fluvalinate)、胺菊酯 (tetramethrin);

[1273] 节肢动物烟碱胆碱能突触 (乙酰胆碱酯酶、乙酰胆碱受体) 的效应物: 溴螨酯 (bromoprypylate)、噁虫威 (bendiocarb)、甲萘威 (carbaryl)、灭多虫 (methomyl)、吡虱威 (promacyl)、残杀威 (propoxur)、甲基吡恶磷 (azamethiphos)、毒虫畏 (chlorfenvinphos)、毒死蜱 (chlorpyrifos)、蝇毒磷 (coumaphos)、赛灭磷 (cythioate)、二嗪农 (diazinon)、

diclorvos、百治磷 (dicrotophos)、乐果 (dimethoate)、乙硫磷 (ethion)、伐灭磷 (famphur)、杀螟硫磷 (fenitrothion)、倍硫磷 (fenthion)、庚烯磷 (heptenophos)、马拉硫磷 (malathion)、二溴磷 (naled)、亚胺硫磷 (phosmet)、胍硫磷 (phoxim)、酞胺硫磷 (phtalofos)、胺丙畏 (propetamphos)、替美磷 (temephos)、司替罗磷 (tetrachlorvinphos)、敌百虫 (trichlorfon)、吡虫啉 (imidacloprid)、烯啶虫胺 (nitenpyram)、呋虫胺 (dinotefuran)、多杀菌素 (spinosad)、乙基多杀菌素 (spinetoram)；
[1274] 节肢动物发展过程的效应物：灭蝇胺 (cyromazine)、地昔尼尔 (dicyclanil)、二氟脲 (diflubenzuron)、氟佐隆 (fluazuron)、氯芬奴隆 (lufenuron)、杀铃脲 (triflumuron)、苯氧威 (fenoxycarb)、烯虫乙酯 (hydroprene)、烯虫酯 (methoprene)、蚊蝇醚 (pyriproxyfen)、苯氧威 (fenoxycarb)、烯虫乙酯 (hydroprene)、S-烯虫酯 (S-methoprene)、蚊蝇醚 (pyriproxyfen)。

[1275] 本发明中作为另外或其它活性成分的来自杀体内寄生虫剂的组的示例性活性成分包括但不限于抗蠕虫活性化合物和抗原生动物活性化合物。

[1276] 抗蠕虫活性化合物包括但不限于下述杀线虫、杀吸虫和/或杀绦虫活性化合物：

[1277] 来自大环内酯类，例如：依立诺克丁 (epinomectin)、阿维菌素 (abamectin)、奈马克丁 (nemadectin)、莫昔克丁 (moxidectin)、多拉克丁 (doramectin)、司拉克丁 (selamectin)、雷皮菌素 (lepimectin)、拉替菌素 (latidectin)、弥拜菌素 (milbemectin)、伊维菌素 (ivermectin)、埃玛菌素 (emamectin)、米尔倍霉素 (milbemycin)；

[1278] 来自苯并咪唑类和probenzimidazoles，例如：奥苯达唑 (oxibendazole)、甲苯咪唑 (mebendazole)、三氯苯咪唑 (triclabendazole)、托布津 (thiophanate)、丁苯咪唑 (parbendazole)、奥吩达唑 (oxfendazole)、奈托比胺 (netobimin)、芬苯达唑 (fenbendazole)、非班太尔 (febantel)、噻苯哒唑 (thiabendazole)、环苯达唑 (cyclobendazole)、坎苯达唑 (cambendazole)、阿苯达唑亚砷 (albendazole sulphoxide)、阿苯达唑 (albendazole)、氟苯达唑 (flubendazole)；

[1279] 来自缩肽类，优选环状缩肽，特别是24元环状缩肽，例如：依吗德塞 (emodepside)、PF1022A；

[1280] 来自四氢嘧啶类，例如：莫仑太尔 (morantel)、噻嘧啶 (pyrantel)、奥克太尔 (oxantel)；

[1281] 来自咪唑并噻唑类，例如：布他咪唑 (butamisole)、左旋咪唑 (levamisole)、四咪唑 (tetramisole)；

[1282] 来自氨基苯基脒类，例如：阿米太尔 (amidantel)、脱酰阿米太尔 (deacylated amidantel (dAMD))、三苯双脒 (tribendimidine)；

[1283] 来自氨基乙脒类，例如：莫奈太尔 (monepantel)；

[1284] 来自对萘啶酰胺类 (Paraherquamides)，例如：对萘啶酰胺 (paraherquamide)、得曲恩特 (derquantel)；

[1285] 来自水杨酰苯胺类，例如：三溴沙仑 (tribromsalan)、溴沙尼特 (bromoxanide)、溴替尼特 (brotianide)、氯碘沙尼 (clioxanide)、氯生太尔 (closantel)、氯硝柳胺 (niclosamide)、羟氯扎胺 (oxyclozanide)、雷复尼特 (rafoxanide)；

[1286] 来自取代的酚类，例如：硝碘酚脒 (nitroxynil)、硫氯酚 (bithionol)、二碘硝酚

(disophenol)、六氯芬(hexachlorophene)、联硝氯酚(niclofolan)、meniclopholan;

[1287] 来自有机磷酸酯类,例如:三氯膦酸酯(trichlorfon)、naphthalofos、敌敌畏(dichlorvos/DDVP)、克芦磷酯(crufomate)、蝇毒磷(coumaphos)、哈洛克酮(haloxon);

[1288] 来自哌嗪酮类/喹啉类,例如:吡喹酮(praziquantel)、依西太尔(epsiprantel);

[1289] 来自哌嗪类,例如:哌嗪(piperazine)、羟嗪(hydroxyzine);

[1290] 来自四环素类,例如:四环素(tetracycline)、金霉素(chlorotetracycline)、多西环素(doxycycline)、土霉素(oxytetracycline)、罗利环素(rolitetracycline);

[1291] 来自不同的其它种类,例如丁萘脒(bunamidine)、尼立达唑(niridazole)、雷琐太尔(resorantel)、omphalotin、奥替普拉(oltipraz)、硝硫氰酯(nitroscanate)、硝碘酚脒(nitroxynil)、奥沙尼喹(oxamniquine)、mirasan、miracil、硫坎酮(lucanthone)、羟胺硫蒽酮(hycanthone)、海涛林(hetolin)、依米丁(emetine)、乙胺嗪(diethylcarbamazine)、双氯酚(dichlorophen)、地芬尼太(diamfenetide)、氯硝西洋(clonazepam)、苄酚宁(bephenium)、硝硫氰胺(amoscanate)、氯舒隆(clorsulon)。

[1292] 本发明的抗原生动物活性成分包括但不限于下述活性成分:

[1293] 来自三嗪类,例如:地克珠利(diclazuril)、帕那珠利(ponazuril)、来曲珠利(letrazuril)、托曲珠利(toltrazuril);

[1294] 来自聚醚离子载体类,例如:莫能菌素(monensin)、盐霉素(salinomycin)、马度米星(maduramicin)、甲基盐霉素(narasin);

[1295] 来自大环内酯类,例如:米尔倍霉素(milbemycin)、红霉素(erythromycin);

[1296] 来自喹诺酮类,例如:恩氟沙星(enrofloxacin)、普拉沙星(pradofloxacin);

[1297] 来自奎宁类,例如:氯喹(chloroquin);

[1298] 来自嘧啶类,例如:乙胺嘧啶(pyrimethamine);

[1299] 来自磺胺类,例如:磺胺喹噁啉(sulfaquinoxaline)、甲氧苄氨嘧啶(trimethoprim)、sulfaclozin;

[1300] 来自硫胺素类,例如:安普罗铵(amprolium);

[1301] 来自林可胺(lincosamides)类,例如:克林霉素(clindamycin);

[1302] 来自甲酰苯胺类,例如:咪多卡(imidocarb);

[1303] 来自硝基咪唑类,例如:硝呋莫司(nifurtimox);

[1304] 来自喹啉酮生物碱类,例如:卤夫酮(halofuginon);

[1305] 来自不同的其它种类,例如:奥沙尼喹(oxamniquin)、巴龙霉素(paromomycin);

[1306] 来自得自微生物的疫苗或抗原类,所述微生物例如:罗氏巴贝斯虫亚种(*Babesia canis rossi*)、柔嫩艾美耳球虫(*Eimeria tenella*)、早熟艾美耳球虫(*Eimeria praecox*)、毒害艾美耳球虫(*Eimeria necatrix*)、缓艾美耳球虫(*Eimeria mitis*)、巨型艾美耳球虫(*Eimeria maxima*)、布氏艾美耳球虫(*Eimeria brunetti*)、堆型艾美耳球虫(*Eimeria acervulina*)、韦氏巴贝斯虫亚种(*Babesia canis vogeli*)、婴儿利什曼原虫(*Leishmania infantum*)、犬巴贝斯虫亚种(*Babesia canis canis*)、胎生网尾线虫(*Dictyocaulus viviparus*)。

[1307] 本发明中所有指出的其它或另外的活性成分如果其官能团允许,则可以与适当的碱或酸形成盐。

[1308] 基于已知用于评价对于治疗蠕虫感染而言有用的化合物的标准实验室技术,通过标准毒性测试和通过用于确定动物中上述指定病况的治疗的标准药理学测定,并且通过将 these 结果与已知的用于治疗这些病况的活性成分或药物的结果进行对比,能够容易地确定治疗各期望适应症的本发明的化合物的有效剂量。在治疗这些病况之一中待施用的活性成分的量可以根据诸如采用的特定化合物和剂量单位、施用模式、治疗时间段、被治疗个体的年龄和性别、以及被治疗病况的性质和程度而发生宽范围地改变。

[1309] 待施用的活性成分的总量将通常为每天约0.001 mg/kg至约200 mg/kg体重,并且优选每天约0.01 mg/kg至约20 mg/kg体重。临床有用的给药方案通常从每天一至三次给药至每四周一次给药而变化。此外,“停药期”是可能的,其中在特定的时间段内不向个体给予药物,从而有益于药理学效果和耐受性之间的总体平衡。进一步,可能进行长效治疗,其中个体在多于四周内接收一次治疗。单位剂型可能含有约0.5 mg至约1500 mg的活性成分,并且可能以每天一次或多次或者少于每天一次施用。通过注射(包括静脉内、肌肉内、皮下和肠胃外注射)和使用输注技术施用的平均每日剂量将优选为0.01至200 mg/kg总体重。平均每日直肠剂量方案将优选为0.01至200 mg/kg总体重。平均每日阴道剂量方案将优选为0.01至200 mg/kg总体重。平均每日局部剂量方案将优选为每天一至四次施用0.1至200 mg。经皮浓度将优选为维持0.01至200 mg/kg的每日剂量所需的浓度。平均每日吸入剂量方案将优选为0.01至100 mg/kg总体重。

[1310] 当然,对于每个个体而言,具体的初始和持续剂量方案将根据参诊医生确定的病况的性质和严重程度、所采用的具体化合物的活性、个体的年龄和总体情况、施用时间、施用途径、药物排泄率、药物组合等而改变。本发明的化合物或者其药学上可接受的盐或酯或组合物的期望治疗模式和剂量数可以由本领域技术人员使用常规的治疗测试而确定。

[1311] 实验部分

[1312] 缩略语:

[1313]

aq.	含水的
DMF	二甲基甲酰胺
DMSO	二甲基亚砜
MTBE	甲基叔丁基醚
THF	四氢呋喃

[1314] 本申请中描述的发明的各个方面通过下述实施例说明,所述实施例不意味着以任何形式限制本发明。

[1315] 本文中描述的实施例测试实验用于说明本发明,并且本发明不限制于给出的实施例。

[1316] 实验部分-总述部分

[1317] 所有在实验部分没有描述合成的反应试剂是商购可得的,或者是已知的化合物,或者可以通过已知方法由本领域技术人员从已知化合物形成。

[1318] 根据本发明的方法产生的化合物和中间体可以要求纯化。有机化合物的纯化是本领域技术人员公知的,并且可以存在多种纯化相同化合物的方式。在一些情况中,可以不必纯化。在一些情况中,所述化合物可以通过结晶纯化。在一些情况中,可以使用适当的溶剂将杂质搅拌出来。在一些情况中,所述化合物可以通过色谱,特别是快速柱色谱,使用例如

预填充的硅胶小柱(例如Biotage SNAP小柱KP-Sil[®]或KP-NH[®])与Biotage自动纯化系统(SP4[®]或Isolera Four[®])和洗脱液(诸如己烷/乙酸乙酯或二氯甲烷/甲醇的梯度)的组合,来纯化。在一些情况中,所述化合物可以通过制备用HPLC,使用例如装配有二极管阵列检测器和/或在线电喷雾离子化质谱的Waters自动纯化器与适合的预填充反相柱和洗脱液(诸如水和乙腈的梯度(其可以包含添加剂,诸如三氟乙酸、甲酸或氨水))的组合,来纯化。

[1319] 在一些情况中,如上文所述的纯化方法可能以盐的形式提供具备充分碱性或酸性官能度的本发明的那些化合物,诸如,在充分碱性的本发明的化合物的情况中,例如以三氟乙酸盐或甲酸盐的形式提供,或者在充分酸性的本发明的化合物的情况中,例如以铵盐的形式提供。该类型的盐可以分别通过本领域技术人员已知的多种方法而转变为其游离碱或游离酸形式,或者在后续的生物测定中以盐形式使用。要理解的是,在本文中分离并描述的本发明的化合物的具体形式(例如盐、游离碱等)不必然是其中所述化合物可以应用于生物测定从而对具体生物活性进行定量的唯一形式。

[1320] 分析和色谱方法

[1321] 分析用和制备用液相色谱

[1322] 分析用(UP)LC-MS借助于如下所述的不同装置实施。质量(m/z)除非指明了负模式(ESI-),否则由正模式电喷雾电离报告。

[1323] 方法L0:

[1324] logP值的测量根据EEC指令79/831附件V.A8,通过HPLC(高效液相色谱)在反相柱上以下述方法实施:

[1325] ^[a]通过在酸性范围,用0.1%甲酸/水和乙腈作为洗脱液(线性梯度,10%乙腈至95%乙腈)测量LC-UV确定logP值;

[1326] ^[b]通过在中性范围,用0.001 摩尔(molar)乙酸铵水溶液和乙腈作为洗脱液(线性梯度,10%乙腈至95%乙腈)测量LC-UV确定logP值。

[1327] 用具有已知logP值(利用连续的烷酮类之间的线性插值使用保留时间测量logP值)的直链烷-2-酮类(具有3至16个碳原子)完成校准。使用200 nm至400 nm的UV光谱和色谱信号的峰值确定 λ_{\max} 值。

[1328] M+1 (或M+H) 分别指分子离子峰加或减1 a.m.u.(原子量单位),如在利用电喷雾电离(ESI+或-)的质谱中观察到的。

[1329] 方法L1:

[1330] 仪器类型: Waters ACQUITY SQD UPLC系统; 柱:Waters Acquity UPLC HSS T3 1.8 μ 50 x 1 mm; 洗脱液A: 1 l水+ 0.25 ml甲酸,洗脱液B: 1 l 乙腈 + 0.25 ml甲酸; 梯度:0.0 min 90% A \rightarrow 1.2 min 5% A \rightarrow 2.0 min 5% A 烘箱: 50°C; 流速: 0.40 ml/min; UV-检测: 208 - 400 nm。

[1331] 方法L2:

[1332] MS 仪器类型: Agilent Technologies 6130 Quadrupole LC-MS; HPLC 仪器类型: Agilent Technologies 1260 Infinity; 柱:Waters XSelect (C18,50x2.1mm,3.5 μ); 流速: 0.8 mL/min;柱温: 35°C; 洗脱液A: 0.1%甲酸/乙腈; 洗脱液B: 0.1%甲酸/水; 线性梯度:t=0 min 5% A,t=3.5 min 98% A,t=6 min 98% A; 检测: DAD (220-320 nm); 检测: MSD (ESI 正/负) 质量范围: 100 - 800; 检测: ELSD (PL-ELS 2100): 气

体流速 1.2 mL/min,气体温度: 70℃,雾化气: 50℃。

[1333] 方法L3:

[1334] MS 仪器类型: Agilent Technologies LC/MSD SL; HPLC 仪器类型: Agilent Technologies 1100 Series; 柱:Waters XSelect (C18,50x2.1mm,3.5 μ ; 流速: 0.8 mL/min;柱温: 25℃; 洗脱液A: 95% 乙腈 + 5% 水中的10 mM 碳酸氢铵; 洗脱液B: 水中的10 mM 碳酸氢铵pH=9.0; 线性梯度:t=0 min 5% A,t=3.5 min 98% A,t=6 min 98% A; 检测: DAD (220-320 nm); 检测: MSD (ESI 正/负) 质量范围: 100-800。

[1335] 方法L4:

[1336] 仪器类型: Waters ACQUITY SQD UPLC系统; 柱:Waters Acquity UPLC HSS T3 1.8 μ 50 x 1 mm; 洗脱液A: 1 l水+ 0.25 ml 99%ige的甲酸,洗脱液B: 1 l 乙腈 + 0.25 ml 99%ige的甲酸; 梯度:0.0 min 95% A \rightarrow 6.0 min 5% A \rightarrow 7.5 min 5% A 烘箱: 50℃; 流速: 0.35 ml/min; UV-检测: 210 - 400 nm。

[1337] 方法L5:

[1338] MS 仪器类型: Waters SQD; 仪器HPLC: Waters UPLC; 柱:Zorbax SB-Aq (Agilent),50 mm x 2.1 mm,1.8 μ m; 洗脱液A:水+ 0.025%甲酸,洗脱液B: 乙腈 (ULC) + 0.025%甲酸; 梯度:0.0 min 98%A - 0.9 min 25%A - 1.0 min 5%A - 1.4 min 5%A - 1.41 min 98%A - 1.5 min 98%A; 烘箱: 40℃; 流速: 0.600 ml/min; UV-检测: DAD; 210 nm。

[1339] 方法L6:

[1340] MS 仪器类型: Thermo Scientific FT-MS; HPLC 仪器类型: Thermo Scientific UltiMate 3000; 柱:Waters,HSST3,2.1 x 75 mm,C18 1.8 μ m; 洗脱液A: 1 l水+ 0.01%甲酸; 洗脱液B: 1 l 乙腈+ 0.01%甲酸; 梯度:0.0 min 10% B \rightarrow 2.5 min 95% B \rightarrow 3.5 min 95% B;烘箱: 50℃; 流速: 0.90 ml/min; UV-检测: 210 nm /最佳积分(integration)路径 210-300 nm。

[1341] 方法L7:

[1342] MS 仪器类型: Waters (Micromass) Quattro Micro; HPLC 仪器类型: Waters UPLC Acquity; 柱:Waters BEH C18 1.7 μ 50 x 2.1 mm; 洗脱液A: 1 l水+ 0.01 mol 甲酸铵,洗脱液B: 1 l 乙腈; 梯度:0.0 min 95% A \rightarrow 0.1 min 95% A \rightarrow 2.0 min 15% A \rightarrow 2.5 min 15% A \rightarrow 2.51 min 10% A \rightarrow 3.0 min 10% A; 烘箱: 40℃; 流速: 0.5 ml/min; UV-检测: 210 nm。

[1343] 方法L8:

[1344] MS 仪器类型: Waters SQD2; 仪器HPLC: Waters UPLC; 柱:Zorbax SB-Aq (Agilent),50 mm x 2.1 mm,1.8 μ m; 洗脱液A:水+ 0.025%甲酸,洗脱液B: 乙腈 (ULC) + 0.025%甲酸; 梯度:0.0 min 98%A - 0.9 min 25%A - 1.0 min 5%A - 1.4 min 5%A - 1.41 min 98%A - 1.5 min 98%A; 烘箱: 40℃; 流速: 0.600 ml/min; UV-检测: DAD; 210 nm。

[1345] 方法L9:

[1346] MS 仪器类型: Agilent Technologies LC/MSD SL; HPLC 仪器类型: Agilent Technologies 1100 Series; 柱:Waters XSelect (C18,50x2.1mm,3.5 μ ; 流速: 0.8 mL/

min;柱温: 25℃;洗脱液A: 95% 乙腈 + 5% 碳酸氢铵/水;洗脱液B: 水中的10mM碳酸氢铵pH=9.0;线性梯度:t=0 min 5% A,t=3.5min 98% A,t=6 min 98% A;检测: DAD (220-320 nm);检测: MSD (ESI 正/负) 质量范围: 100-800。

[1347] 方法L10:

[1348] MS 仪器类型: Agilent Technologies 6130 Quadrupole LC-MS; HPLC 仪器类型: Agilent Technologies 1260 Infinity; 柱:Waters XSelect (C18,30x2.1mm,3.5 μ); 流速: 1 mL/min;柱温: 35℃;洗脱液A: 0.1%甲酸/乙腈;洗脱液B: 0.1%甲酸/水;线性梯度:t=0 min 5% A,t=1.6min 98% A,t=3 min 98% A;检测: DAD (220-320 nm);检测: MSD (ESI 正/负) 质量范围: 100 - 800;检测: ELSD (PL-ELS 2100): 气体流速 1.2 mL/min,气体温度: 70℃,雾化气: 50℃。

[1349] 方法L11:

[1350] MS 仪器类型: Agilent Technologies LC/MSD SL; HPLC 仪器类型: Agilent Technologies 1100 Series; 柱:Phenomenex Gemini NX (C18,50x2.0mm),3.0μ; 流速: 0.8 mL/min;柱温: 25℃;洗脱液A: 95% 乙腈 + 5% 水中的10mM 碳酸氢铵/乙腈 pH=9.0;洗脱液B: 10 水中的10mM 碳酸氢铵pH=9.0;线性梯度:t=0 min 5% A,t=3.5 min 98% A,t=6 min 98% A;检测: DAD (220-320 nm);检测: MSD (ESI 正/负) 质量范围: 100-800。

[1351] 方法L12:

[1352] MA 仪器: Agilent MS Quad 6150; HPLC 仪器: Agilent 1290; 柱:Waters Acquity UPLC HSS T3 1.8 μm 50 x 2.1 mm;洗脱液A: 1 l水+ 0.25 ml 99%甲酸,洗脱液B: 1 l 乙腈+ 0.25 ml 99%甲酸;梯度:0.0 min 90% A → 0.3 min 90% A → 1.7 min 5% A → 3.0 min 5% A 烘箱: 50℃;流速: 1.20 ml/min;UV-检测: 205 - 305 nm。

[1353] 方法M1:

[1354] 使用的柱为Shim-pack XR-ODS,2.2 μm,3.0 × 50 mm。经1.80 min施加线性梯度,起始于95% A (A: 0.05% TFA/水)并且结束于100% B (B: 0.05% TFA/MeCN),总的跑柱时间为2.10 min。柱温为45℃,流速为1.20 mL/min。

[1355] 方法M2:

[1356] 使用的柱为EVO,2.6 μm,3.0 × 50 mm。经4.20 min施加线性梯度,起始于90% A (A: 0.1% FA/水)并且结束于95% B (B: 0.1% FA/MeCN),总的跑柱时间为4.50 min。柱温为40℃,流速为1.00 mL/min。

[1357] 方法M3:

[1358] 使用的柱为CORTECS C18,2.7 μm,2.1 × 50 mm。经1.70 min施加线性梯度,起始于95% A (A: 0.09% FA/水)并且结束于100% B (B: 0.1% FA/MeCN),总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40℃,流速为1.00 mL/min。

[1359] 方法M4:

[1360] 使用的柱为CORTECS C18+,2.7 μm,2.1 × 50 mm。经1.70 min施加线性梯度,起始于90% A (A: 0.1% FA/水)并且结束于100% B (B: 0.1% FA/MeCN),总的跑柱时间为2.00 min。柱温为45℃,流速为1.00 mL/min。

[1361] 方法M5:

[1362] 使用的柱为Kinetex EVO C18, 2.6 μm , 3.0 \times 50 mm。经1.70 min施加线性梯度, 起始于90% A (A: 0.1% FA/水) 并且结束于100% B (B: 0.1% FA/MeCN), 总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1363] 方法M6:

[1364] 使用的柱为CORTECS C18, 2.7 μm , 2.1 \times 50 mm。经2.60 min施加线性梯度, 起始于95% A (A: 0.09% FA/水) 并且结束于100% B (B: 0.1% FA/MeCN), 总的跑柱时间为3.00 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1365] 方法M7:

[1366] 使用的柱为Shim-pack XR-ODS, 2.2 μm , 3.0 \times 50 mm。经2.80 min施加线性梯度, 起始于95% A (A: 0.05% TFA/水) 并且结束于100% B (B: 0.05% TFA/MeCN), 总的跑柱时间为3.30 min。柱温为45 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.20 mL/min。

[1367] 方法M8:

[1368] 使用的柱为CORTECS C18+, 2.7 μm , 2.1 \times 50 mm。经1.70 min施加线性梯度, 起始于90% A (A: 0.1% FA/水) 并且结束于100% B (B: 0.1% FA/MeCN), 总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1369] 方法M9:

[1370] 使用的柱为Kinetex EVO C18, 2.6 μm , 3.0 \times 50 mm。经4.20 min施加线性梯度, 起始于90% A (A: 0.1% FA/水) 并且结束于95% B (B: 0.1% FA/MeCN), 总的跑柱时间为4.50 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1371] 方法M10:

[1372] 使用的柱为Kinetex EVO C18, 2.6 μm , 3.0 \times 50 mm。经1.70 min施加线性梯度, 起始于90% A (A: 0.1% FA/水) 并且结束于100% B (B: 0.1% FA/MeCN), 总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1373] 方法M11:

[1374] 使用的柱为CORTECS C18+, 2.7 μm , 2.1 \times 50 mm。经2.70 min施加线性梯度, 起始于90% A (A: 0.1% FA/水) 并且结束于95% B (B: 0.1% FA/MeCN), 总的跑柱时间为3.00 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1375] 方法M12:

[1376] 使用的柱为Ascentis Express C18, 2.7 μm , 3.0 \times 50 mm。经1.70 min施加线性梯度, 起始于90% A (A: 0.09% FA/水) 并且结束于100% B (B: 0.1% FA/MeCN), 总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.50 mL/min。

[1377] 方法M13:

[1378] 使用的柱为Ascentis Express C18, 2.7 μm , 2.1 \times 50 mm。经1.70 min施加线性梯度, 起始于95% A (A: 0.05% TFA/水) 并且结束于100% B (B: 0.05% TFA/MeCN), 总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1379] 方法M14:

[1380] 使用的柱为Ascentis Express C18, 2.7 μm , 2.1 \times 50 mm。经2.70 min施加线性梯度, 起始于95% A (A: 0.05% TFA/水) 并且结束于95% B (B: 0.05% TFA/MeCN), 总的跑

柱时间为3.00 min。柱温为40℃,流速为1.00 mL/min。

[1381] 方法M15:

[1382] 使用的柱为Ascentis Express C18,2.7 μm,2.1 × 50 mm。经2.70 min施加线性梯度,起始于70% A (A: 0.05% TFA/水)并且结束于95% B (B: 0.05% TFA/MeCN),总的跑柱时间为3.00 min。柱温为40℃,流速为1.00 mL/min。

[1383] 方法M16:

[1384] 使用的柱为CORTECS C18,2.7 μm,2.1 × 50 mm。经1.70 min施加线性梯度,起始于95% A (A: 0.09% FA/水)并且结束于100% B (B: 0.1% FA/MeCN),总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40℃,流速为1.00 mL/min。

[1385] 方法M17:

[1386] 使用的柱为CORTECS C18+ 100A,2.7 μm,2.1 × 50 mm。经1.60 min施加线性梯度,起始于90% A (A: 0.1% FA/水)并且结束于100% B (B: 0.1% FA/MeCN),总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40℃,流速为1.00 mL/min。

[1387] 方法M18:

[1388] 使用的柱为Kinetex EVO C18,2.6 μm,3.0 × 50 mm。经1.70 min施加线性梯度,起始于90% A (A: 0.09% FA/水)并且结束于100% B (B: 0.1% FA/MeCN),总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40℃,流速为1.00 mL/min。

[1389] 方法M19:

[1390] 使用的柱为Kinetex EVO C18 100A,2.6 μm,3.0 × 50 mm。经1.60 min施加线性梯度,起始于90% A (A: 0.1% FA/水)并且结束于100% B (B: 0.1% FA/MeCN),总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40℃,流速为1.00 mL/min。

[1391] 方法M20:

[1392] 使用的柱为Ascentis Express C18,2.7 μm,3.0 × 50 mm。经1.70 min施加线性梯度,起始于95% A (A: 0.05% TFA/水)并且结束于95% B (B: 0.05% TFA/MeCN),总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40℃,流速为1.50 mL/min。

[1393] 方法M21:

[1394] 使用的柱为Kinetex EVO C18,2.6 μm,3.0 × 50 mm。经1.70 min施加线性梯度,起始于90% A (A: 0.09% FA/水)并且结束于100% B (B: 0.1% FA/MeCN),总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40℃,流速为1.50 mL/min。

[1395] 方法M22:

[1396] 使用的柱为Kinetex EVO C18,2.6 μm,3.0 × 50 mm。经2.70 min施加线性梯度,起始于90% A (A: 0.09% FA/水)并且结束于95% B (B: 0.1% FA/MeCN),总的跑柱时间为3.00 min。柱温为40℃,流速为1.50 mL/min。

[1397] 方法M23:

[1398] 使用的柱为Ascentis Express C18,2.7 μm,3.0 × 50 mm。经2.70 min施加线性梯度,起始于90% A (A: 0.09% FA/水)并且结束于95% B (B: 0.1% FA/MeCN),总的跑柱时间为3.00 min。柱温为40℃,流速为1.50 mL/min。

[1399] 方法M24:

[1400] 使用的柱为Ascentis Express C18,2.7 μm,3.0 × 50 mm。经2.70 min施加线性

梯度,起始于95% A (A: 0.05% TFA/水)并且结束于95% B (B: 0.05% TFA/MeCN),总的跑柱时间为3.00 min。柱温为40℃,流速为1.50 mL/min。

[1401] 方法M25:

[1402] 使用的柱为Kinetex EVO C18,2.6 μm,4.6 × 50 mm。经1.75 min施加线性梯度,起始于90% A (A: 水中的5mMNH₄HCO₃)并且结束于95% B (B: MeCN),总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40℃,流速为1.80 mL/min。

[1403] 方法M26:

[1404] 使用的柱为Ascentis Express C18,2.7 μm,3.0 × 50 mm。经4.90 min施加线性梯度,起始于95% A (A: 0.05% TFA/水)并且结束于95% B (B: 0.05% TFA/MeCN),总的跑柱时间为5.30 min。柱温为45℃,流速为1.50 mL/min。

[1405] 方法M27:

[1406] 使用的柱为Poroshell HPH-C18,2.7 μm,3.0 × 50 mm。经1.70 min施加线性梯度,起始于95% A (A: 0.1% FA/水)并且结束于100% B (B: 0.1% FA/MeCN),总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40℃,流速为1.00 mL/min。

[1407] 方法M28:

[1408] 使用的柱为CORTECS C18+,2.7 μm,2.1 × 50 mm。经2.70 min施加线性梯度,起始于90% A (A: 0.1% FA/水)并且结束于95% B (B: 0.1% FA/MeCN),总的跑柱时间为3.00 min。柱温为45℃,流速为1.00 mL/min。

[1409] 方法M29:

[1410] 使用的柱为Shim-pack XR-ODS,2.2 μm,3.0 × 50 mm。经4.60 min施加线性梯度,起始于95% A (A: 0.05% TFA/水)并且结束于100% B (B: 0.05% TFA/MeCN),总的跑柱时间为5.30 min。柱温为40℃,流速为1.20 mL/min。

[1411] 方法M30:

[1412] 使用的柱为Shim-pack XR-ODS,2.2 μm,3.0 × 50 mm。经2.80 min施加线性梯度,起始于95% A (A: 0.05% TFA/水)并且结束于100% B (B: 0.05% TFA/MeCN),总的跑柱时间为3.30 min。柱温为45℃,流速为1.20 mL/min。

[1413] 方法M31:

[1414] 使用的柱为Shim-pack XR-ODS,2.2 μm,3.0 × 50 mm。经4.70 min施加线性梯度,起始于95% A (A: 0.05% TFA/水)并且结束于100% B (B: 0.05% TFA/MeCN),总的跑柱时间为5.00 min。柱温为45℃,流速为1.20 mL/min。

[1415] 方法M32:

[1416] 使用的柱为CORTECS C18+,2.7 μm,2.1 × 50 mm。经5.20 min施加线性梯度,起始于90% A (A: 0.1% FA/水)并且结束于95% B (B: 0.1% FA/MeCN),总的跑柱时间为5.70 min。柱温为45℃,流速为1.00 mL/min。

[1417] 方法M33:

[1418] 使用的柱为Shim-pack XR-ODS,2.2 μm,3.0 × 50 mm。经2.20 min施加线性梯度,起始于95% A (A: 0.05% TFA/水)并且结束于100% B (B: 0.05% TFA/MeCN),总的跑柱时间为2.60 min。柱温为40℃,流速为1.00 mL/min。

[1419] 方法M34:

[1420] 使用的柱为Shim-pack XR-ODS, 2.2 μm , 3.0 \times 50 mm。经1.70 min施加线性梯度, 起始于95% A (A: 0.05% TFA/水) 并且结束于100% B (B: 0.05% TFA/MeCN), 总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.20 mL/min。

[1421] 方法M35:

[1422] 使用的柱为CORTECS C18+, 2.7 μm , 2.1 \times 50 mm。经2.70 min施加线性梯度, 起始于95% A (A: 0.09% FA/水) 并且结束于95% B (B: 0.1% FA/MeCN), 总的跑柱时间为3.00 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1423] 方法M36:

[1424] 使用的柱为CORTECS C18+ 100A, 2.7 μm , 2.1 \times 50 mm。经2.60 min施加线性梯度, 起始于90% A (A: 0.1% FA/水) 并且结束于100% B (B: 0.1% FA/MeCN), 总的跑柱时间为3.00 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1425] 方法M37:

[1426] 使用的柱为CORTECS C18, 2.7 μm , 2.1 \times 50 mm。经2.60 min施加线性梯度, 起始于95% A (A: 0.09% FA/水) 并且结束于95% B (B: 0.1% FA/MeCN), 总的跑柱时间为3.00 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1427] 方法M38:

[1428] 使用的柱为CORTECS C18, 2.7 μm , 2.1 \times 50 mm。经1.80 min施加线性梯度, 起始于95% A (A: 0.05% TFA/水) 并且结束于100% B (B: 0.05% TFA/MeCN), 总的跑柱时间为2.00 min。柱温为45 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1429] 方法M39:

[1430] 使用的柱为Ascentis Express C18, 2.7 μm , 2.1 \times 50 mm。经5.70 min施加线性梯度, 起始于70% A (A: 0.05% TFA/水) 并且结束于95% B (B: 0.05% TFA/MeCN), 总的跑柱时间为6.50 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1431] 方法M40:

[1432] 使用的柱为Ascentis Express C18, 2.7 μm , 2.1 \times 50 mm。经2.70 min施加线性梯度, 起始于60% A (A: 0.05% TFA/水) 并且结束于95% B (B: 0.05% TFA/MeCN), 总的跑柱时间为3.00 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1433] 方法M41:

[1434] 使用的柱为Kinetex EVO C18, 2.6 μm , 3.0 \times 50 mm。经1.80 min施加线性梯度, 起始于90% A (A: 水中的5 mM NH_4HCO_3) 并且结束于95% B (B: MeCN), 总的跑柱时间为2.00 min。柱温为45 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.50 mL/min。

[1435] 方法M42:

[1436] 使用的柱为Shim-pack XR-ODS, 2.2 μm , 3.0 \times 50 mm。经1.70 min施加线性梯度, 起始于95% A (A: 0.05% TFA/水) 并且结束于100% B (B: 0.05% TFA/MeCN), 总的跑柱时间为2.00 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.20 mL/min。

[1437] 方法M43:

[1438] 使用的柱为Kinetex EVO C18 100A, 2.6 μm , 2.1 \times 50 mm。经2.60 min施加线性梯度, 起始于90% A (A: 水中的5 mM NH_4HCO_3) 并且结束于95% B (B: MeCN), 总的跑柱时间为3.00 min。柱温为40 $^{\circ}\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1439] 方法M44:

[1440] 使用的柱为HPH-C18, 2.7 μm , 3.0 \times 50 mm。经2.60 min施加线性梯度, 起始于90% A (A: 水中的5 mM NH_4HCO_3) 并且结束于100% B (B: MeCN), 总的跑柱时间为3.00 min。柱温为40 $^\circ\text{C}$, 流速为1.50 mL/min。

[1441] 方法45:

[1442] 使用的柱为Ascentis Express C18, 2.7 μm , 2.1 \times 50 mm。经3.10 min施加线性梯度, 起始于95% A (A: 0.05% TFA/水) 并且结束于95% B (B: 0.05% TFA/MeCN), 总的跑柱时间为3.60 min。柱温为40 $^\circ\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1443] 方法M46:

[1444] 使用的柱为Ascentis Express C18, 2.7 μm , 2.1 \times 50 mm。经2.10 min施加线性梯度, 起始于95% A (A: 0.05% TFA/水) 并且结束于100% B (B: 0.05% TFA/MeCN), 总的跑柱时间为2.60 min。柱温为40 $^\circ\text{C}$, 流速为1.00 mL/min。

[1445] 方法M47:

[1446] 使用的柱为Ascentis Express C18, 2.7 μm , 3.0 \times 50 mm。经4.20 min施加线性梯度, 起始于95% A (A: 0.05% TFA/水) 并且结束于95% B (B: 0.05% TFA/MeCN), 总的跑柱时间为4.50 min。柱温为40 $^\circ\text{C}$, 流速为1.50 mL/min。

[1447] 方法M48:

[1448] 使用的柱为Shim-pack XR-ODS, 2.2 μm , 3.0 \times 50 mm。经5.00 min施加线性梯度, 起始于80% A (A: 0.05% TFA/水) 并且结束于95% B (B: 0.05% TFA/MeCN), 总的跑柱时间为5.60 min。柱温为45 $^\circ\text{C}$, 流速为1.20 mL/min。

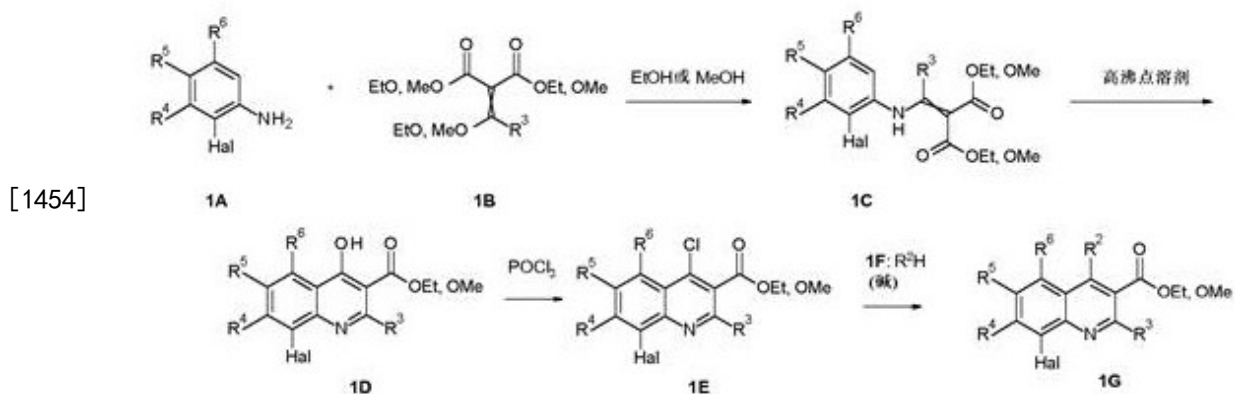
[1449] ^1H -NMR数据用Bruker Avance 400 (配备有流动池(60 μl 体积), 或Bruker AVIII 400 (配备有1.7 mm冷冻CPTCI探头), 或Bruker AVIII 400 (400.13 MHz) (配备有5mm探头), 或Bruker AVII 600 (600.13 MHz) (配备有5 mm冷冻TCI探头), 或Bruker AVIII 600 (601.6 MHz) (配备有5 mm冷冻CPMNP探头), 或Bruker AVIII 500 (500.13 MHz) (配备有5 mm宽带头或5 mm ProdigyTM 探头), 以四甲基硅烷作为参比(0.0) 并且以溶剂 CD_3CN 、 CDCl_3 或 D_6 -DMSO, 进行测定。或者 ^1H -和 ^{13}C -NMR 仪器类型: Bruker DMX300 (^1H -NMR: 300 MHz; ^{13}C NMR: 75 MHz), Bruker Avance III 400 (^1H -NMR: 400 MHz; ^{13}C NMR: 100 MHz) 或Bruker 400 Ultrashield (^1H -NMR: 400 MHz; ^{13}C NMR: 100 MHz)。

[1450] 化学位移(δ)以百万分率[ppm]表示; 使用下述简称: s = 单峰, d = 二重峰, t = 三重峰, q = 四重峰, m = 多重峰, br. = 宽峰; 偶合常数以赫兹[Hz]表示

[1451] 实验部分-一般程序

[1452] 式(I)的化合物的合成可以根据或类似于下述方案(方案1a-e、方案2和方案3)实施。

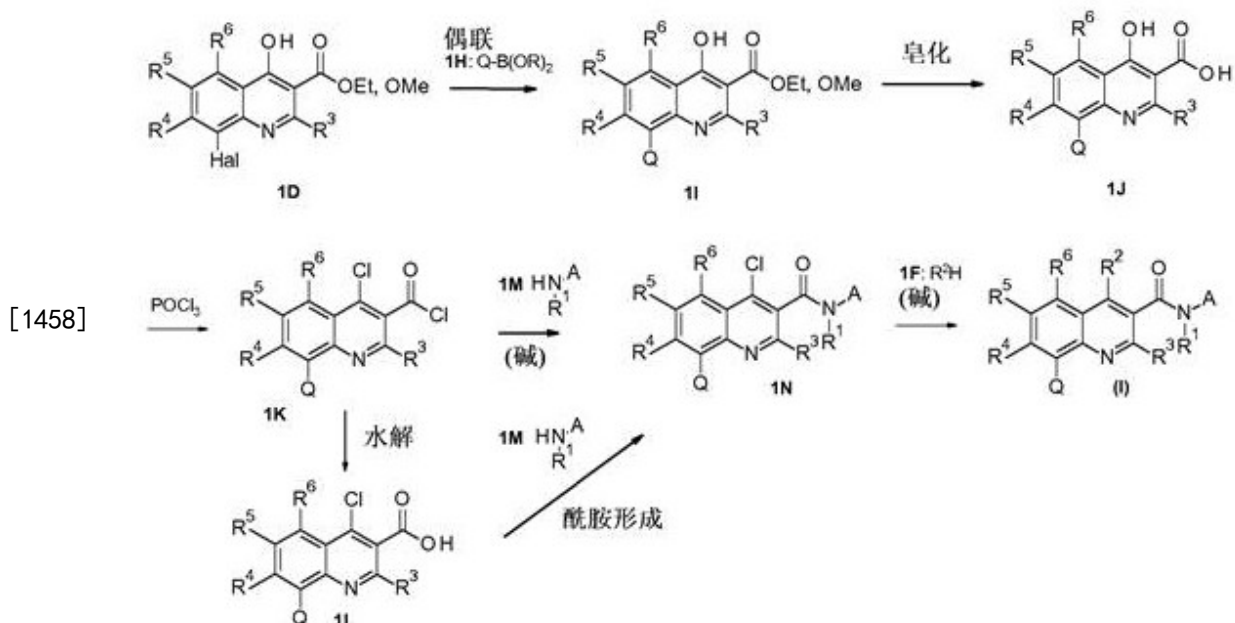
[1453] 方案1a



[1455] 2-卤素取代的苯胺1A (Hal = 碘、溴、氯) 是商购可得的并且可以容易地用(烷氧基亚甲基)丙二酸酯1B, 由相应的醇溶剂溶解, 优选在沸腾条件下, 转化成(苯胺基亚甲基)丙二酸酯1C(如Monatshefte fuer Chemie, 2015, 146 (2), 291-302中所述), 或者没有任何溶剂(如W0 2002004444中所述)。闭环在高沸点溶剂中, 优选在二苯醚或二甲苯中进行, 以获得如W0 2013118071中所述的羟基喹啉1D。羟基喹啉1D可以用氯化试剂(优选如W02013118071中所述的回流 POCl_3)容易地转化成相应的氯化物1E。

[1456] 取决于亲核试剂 R^2H 1F的性质, 氯代喹啉1E与1F在碱存在下反应, 所述碱例如为乙醇钠、甲醇钠、叔丁醇钾、三乙胺、*N,N*-二异丙基乙胺、二氮杂双环十一烷、氢化钠、氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸钾、碳酸铯等, 得到酯中间体1G。

[1457] 方案 1b

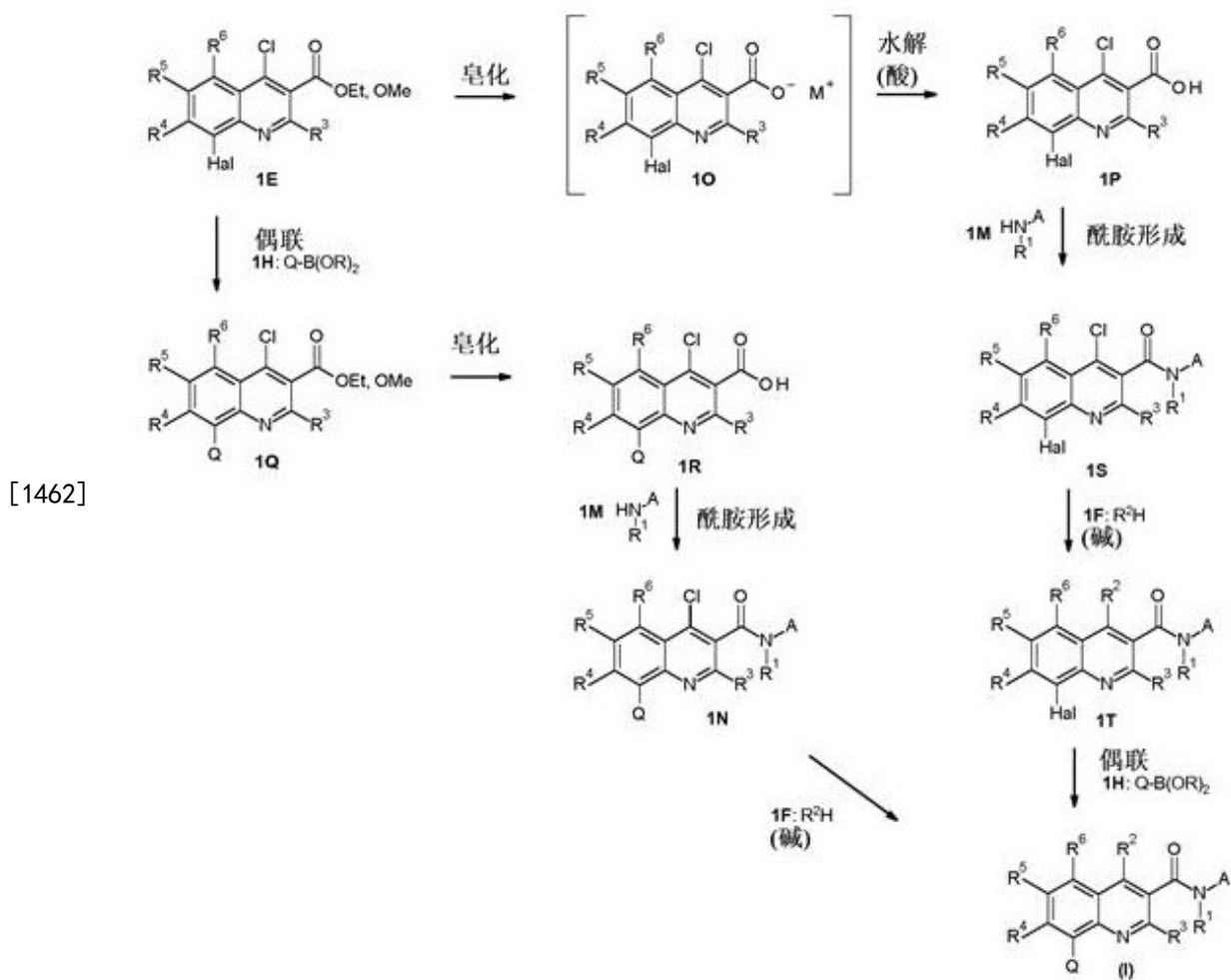


[1459] 或者, 中间体1D与硼酸或硼酸酯1H Q-B(OR)_2 ($\text{R}=\text{H}$; $\text{R}=\text{Me}$ 或者 R,R =频哪醇基)的Suzuki交叉偶联反应生成酯中间体1I, 如Chem. Soc. Rev. 2014, 43, 412-443中或在Tetrahedron 2002, 58 (48), 9633-9695中所述。随后, 可将酯中间体1I平稳地皂化(例如用氢氧化锂)得到相应的甲酸1J, 其可以用氯化试剂(优选回流 POCl_3)容易地转化成相应的氯代甲酰氯1K, 如W02013096151中所述。中间体1K在水解条件下反应得到喹诺酮甲酸1L, 其经由酰胺形成和脱水试剂(例如*N*-(3-二甲基氨基异丙基)-*N'*-乙基碳二亚胺-盐酸盐(EDC))

与可商购的有机胺1M结合,得到酰胺1N。类似的合成描述在例如Journal of Medicinal Chemistry 2012,55,3563-3567中。中间体1K可直接形成酰胺1N,因为甲酰氯1K与胺1M在碱性条件(例如吡啶、三乙胺或*N,N*-二异丙基乙胺)下结合,如Chemical Biology & Drug Design 2015, 85 (5),549-564中所述。

[1460] 取决于亲核试剂 R^2H 1F的性质,氯喹啉1N与1F在碱(例如乙醇钠、甲醇钠、叔丁醇钾、三乙胺、*N,N*-二异丙基乙胺、二氮杂双环十一烷、氯化钠、氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸钾、碳酸铯等)存在下反应,得到式(I)的目标化合物。

[1461] 方案 1c

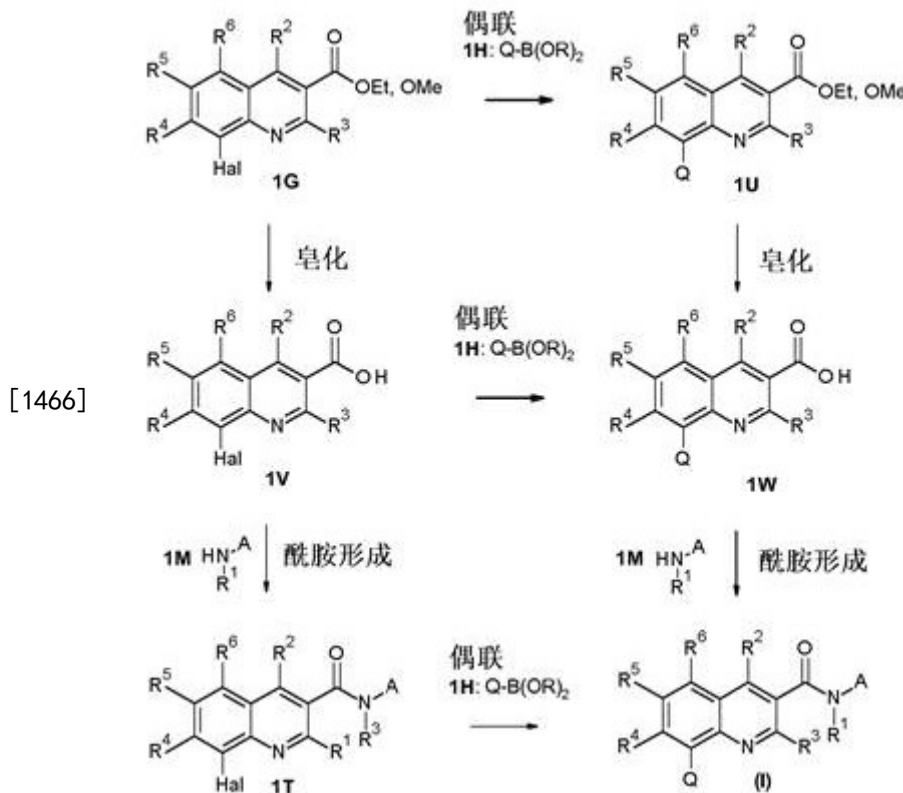


[1463] 氯喹啉1E可以例如用氢氧化锂平稳地皂化,产生相应的甲酸盐1O,例如作为锂盐得到,或在酸水解后产生甲酸1P。随后,通过酰胺偶联条件,得到中间体甲酰胺1S,例如,经由由1P形成的甲酰氯,其与胺1M在碱性条件(例如吡啶、三乙胺或*N,N*-二异丙基乙胺)下结合,或者经由由甲酸1P与胺1M和脱水试剂(例如*N*-(3-二甲基氨基异丙基)-*N'*-乙基碳二亚胺-盐酸盐(EDC))结合的酰胺形成。类似的合成描述于例如Journal of Medicinal Chemistry 2012, 55, 3563-3567中。取决于亲核试剂 R^2H 1F的性质,氯喹啉1S与1F在碱(例如乙醇钠、甲醇钠、叔丁醇钾、三乙胺、*N,N*-二异丙基乙胺、二氮杂双环十一烷、氯化钠、氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸钾、碳酸铯等)存在下反应,得到中间体甲酰胺1T。中间体甲酰胺1T与硼酸或硼酸酯1H $Q-B(OR)_2$ ($R=H$; $R=Me$ 或者 $R,R=$ 频哪醇基)的Suzuki交叉偶联反应(如描述于Chem. Soc. Rev. 2014,43,412-443中或Tetrahedron 2002, 58

(48), 9633-9695中的) 产生式 (I) 的最终产物。

[1464] 或者, 喹啉1E经由Suzuki交叉偶联反应与硼酸或硼酸酯1H Q-B(OR)₂ (R=H; R = Me 或者R,R = 频哪醇基) 反应, 如描述于Chem. Soc. Rev. 2014, 43, 412-443中或Tetrahedron 2002, 58 (48), 9633-9695中的, 提供喹啉甲酸酯1Q, 其可以平稳地皂化(例如用氢氧化锂)以产生相应的喹啉甲酸1R。随后, 通过酰胺偶联条件得到中间体甲酰胺1N, 所述酰胺偶联条件例如, 经由由1R形成的甲酰氯与胺1M在碱性条件(例如吡啶、三乙胺或N,N-二异丙基乙胺)下结合, 或者经由由甲酸1R与胺1M和脱水试剂(例如N-(3-二甲基氨基异丙基)-N'-乙基碳二亚胺-盐酸盐(EDC))结合的酰胺形成。类似的合成描述于例如Journal of Medicinal Chemistry 2012, 55, 3563-3567 中。取决于亲核试剂R²H 1F的性质, 喹啉1N与1F在碱(例如乙醇钠、甲醇钠、叔丁醇钾、三乙胺、N,N-二异丙基乙胺、二氮杂双环十一烷、氯化钠、氢氧化锂、氢氧化钠、氢氧化钾、碳酸钾、碳酸铯等)存在下反应, 也得到式(I)的最终产物。

[1465] 方案 1d

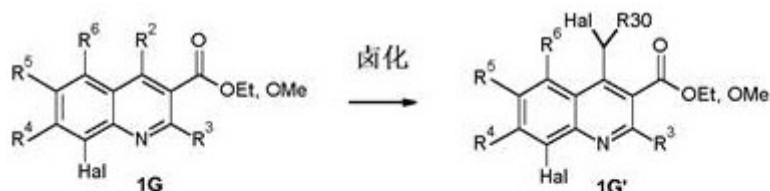


[1467] 喹啉甲酸酯1G可以经由Suzuki交叉偶联反应应用硼酸或硼酸酯1H Q-B(OR)₂ (R=H; R = Me 或者R,R = 频哪醇基) (如描述于Chem. Soc. Rev. 2014, 43, 412-443中或在Tetrahedron 2002, 58 (48), 9633-9695中的) 转化而提供喹啉甲酸酯1U, 其可以平稳地皂化(例如用氢氧化锂)以产生相应的喹啉甲酸1W。随后, 通过酰胺偶联条件得到式(I)的最终产物, 所述酰胺偶联条件例如经由由1W形成的甲酰氯与胺1M在碱性条件(例如吡啶、三乙胺或N,N-二异丙基乙胺)下结合, 或者经由由甲酸1W 与胺1M和脱水试剂(例如N-(3-二甲基氨基异丙基)-N'-乙基碳二亚胺-盐酸盐(EDC))结合的酰胺形成。类似的合成例如描述于Journal of Medicinal Chemistry 2012, 55, 3563-3567中。

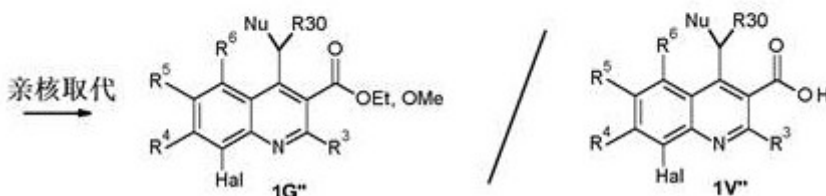
[1468] 或者, 可首先将喹啉甲酸酯1G皂化, 然后经由Suzuki交叉偶联反应应用硼酸或硼酸

酯1H Q-B(OR)₂ (R=H; R = Me 或者R,R = 频哪醇基)转化为喹啉甲酸1W,或者借助于酰胺偶联条件转化成喹啉甲酰胺1T,所述酰胺偶联条件例如经由由1V形成的甲酰氯与胺1M在碱性条件(例如吡啶、三乙胺或N,N-二异丙基乙胺)下结合,或者经由由喹诺酮甲酸1V与胺1M和脱水试剂(例如N-(3-二甲氨基异丙基)-N'-乙基-碳二亚胺-盐酸盐(EDC))结合的酰胺形成。最后,喹啉甲酰胺1T可经由Suzuki交叉偶联反应与硼酸或硼酸酯1H Q-B(OR)₂ (R=H; R = Me 或者R,R = 频哪醇基)(如描述于Chem. Soc. Rev. 2014,43,412-443中或Tetrahedron 2002,58 (48),9633-9695中的)转化成式(I)的最终产物。

[1469] 方案 1d'

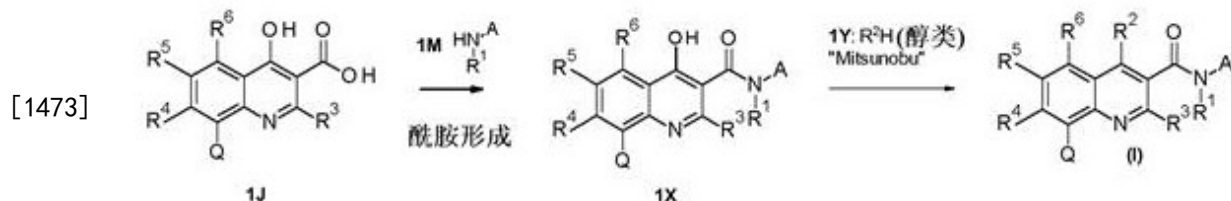


[1470]



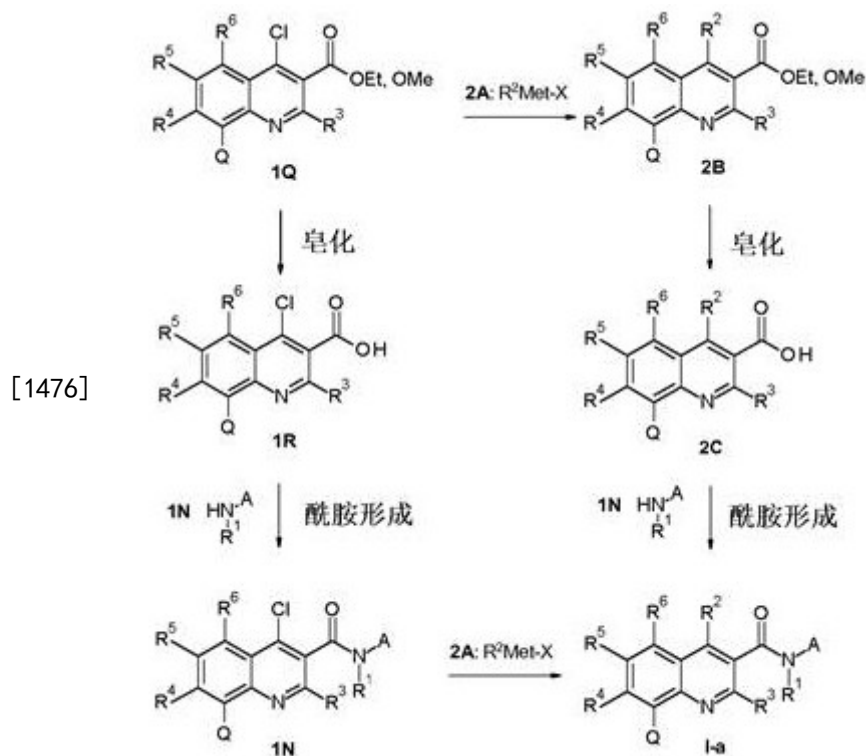
[1471] 1G的亚组,其中R²是烷基(例如甲基(R₃₀ = H))可以被卤化,例如被溴化剂(例如溴、N-溴代丁二酰亚胺、三溴化吡啶鎓或苯基三甲基三溴化铵,)溴化成溴代烷基衍生物1G' (如描述于例如J. Heterocycl. Chem. 1981,第18卷,925 - 928、J. Med. Chem.,2009,第52卷,3047 -3062或J. Am. Chem. Soc.,1948,70,417-418中的)。有时在碱存在下,按照标准程序,这样的溴代烷基化合物1G'可以被亲核试剂如胺、醇或硫醇或它们的盐取代,以提供取代的烷基-喹啉1G''。在亲核取代的反应条件下,酯1G''可以进一步被转化为相应的酸1V'',或者可以将它们分离并在单独的水解步骤中转化成酸1V''。然后,通过方案1d中描述的方法通过酰胺形成和基团Q的偶联,可以从酸1V'获得最终产物(I)。

[1472] 方案 1e (R² = 任选取代的C₁-C₄-烷氧基)



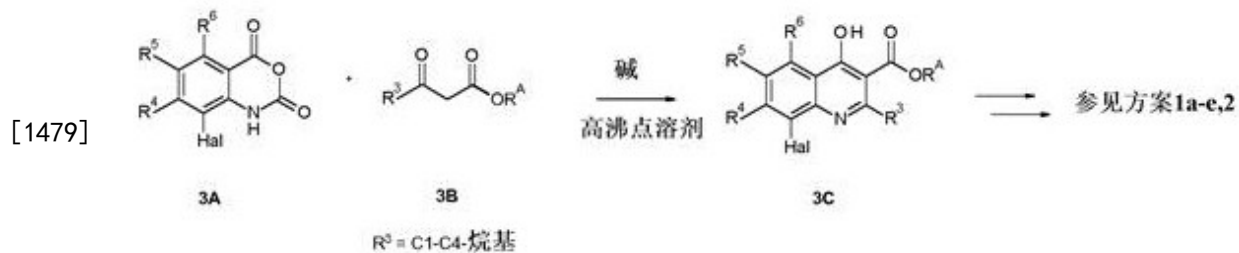
[1474] 羟基喹诺酮1X通过酰胺偶联条件获得,所述酰胺偶联条件例如经由由1J形成的甲酰氯在碱性条件(例如吡啶、三乙胺或N,N-二异丙基乙胺)下与胺1M结合,或经由由甲酸1J与胺1M和脱水试剂(例如N-(3-二甲氨基异丙基)-N'-乙基碳二亚胺-盐酸盐(EDC))结合的酰胺形成。类似的合成描述于例如Journal of Medicinal Chemistry 2012,55,3563-3567中。式(I)的最终产物通过羟基喹诺酮1X与醇类1Y(R² = C₁-C₄-烷氧基,任选取代的)在脱水试剂(例如(E)-二氮烯-1,2-二甲酸二异丙基酯)和三苯基磷存在下的Mitsunobu反应获得,如描述于Organic&Biomolecular Chemistry 2012, 10(32),6537-6546中的。

[1475] 方案 2 ($R^2 = C_1-C_4$ -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_3-C_6 -环烯基、 C_2-C_4 -炔基或苯基- C_1-C_4 -烷基,其各自如对上面定义的通式(I)的化合物所定义任选被取代)



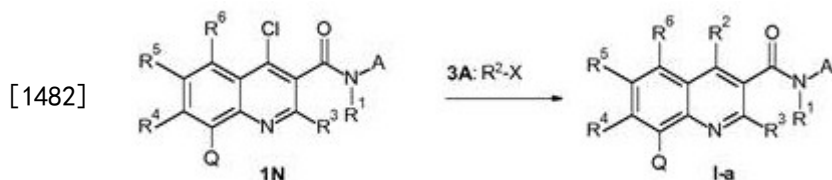
[1477] 喹啉甲酸酯中间体1Q或喹诺酮甲酰胺中间体1N可以用某些格氏-(Grignard-)或金属有机化合物2A(C_1-C_4 -烷基-Met-X、 C_3-C_6 -环烷基-Met-X、 C_2-C_4 -烯基-Met-X、 C_3-C_6 -环烯基-Met-X、 C_2-C_4 -炔基-Met-X或苯基- C_1-C_4 -烷基-Met-X (Met = Mg、Zn; X = I、Br、Cl))引入 C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_2-C_4 -烯基、 C_3-C_6 -环烯基、 C_2-C_4 -炔基或苯基- C_1-C_4 -烷基(其各自如对上面定义的通式(I)的化合物所定义任选被取代)(如描述于例如Tetrahedron Letters,2000,41(33),6387-6391中的)来转化成酯中间体2B或最终化合物I-a。

[1478] 方案 3 ($R^3 = C_1-C_4$ -烷基)



[1480] 获得羟基酯3C ($R^3 = C_1-C_4$ -烷基、 $R^A =$ 甲基、乙基或叔丁基)的一个替代途径使用商购可得的2H-3,1-噁嗪-2,4(1H)-二酮 3A (Hal = 碘、溴、氯)在碱例如氢化钠存在下,在极性高沸点溶剂例如N,N-二甲基乙酰胺中,与酮酯3B ($R^3 = C_1-C_4$ -烷基、 $R^A =$ 甲基、乙基或叔丁基)进行脱羧反应(如描述于US 20080306048中的)。随后的步骤可根据方案1a-e或方案2进行。

[1481] 方案 4



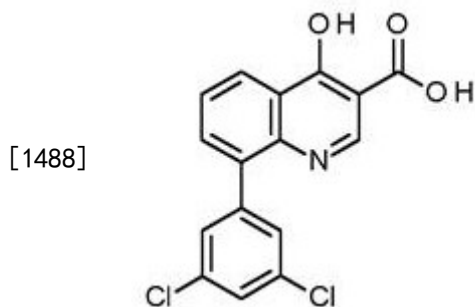
[1483] 喹诺酮甲酰胺中间体1N可通过光氧化还原催化用某些烷基、环烷基和杂环烷基卤化物或甲酸3A (C_1-C_4 -烷基-X、 C_3-C_6 -环烷基-X、 C_3-C_6 -环烯基-X、杂环烷基-X (X = Br、COOH)) 引入 C_1-C_4 -烷基、 C_3-C_6 -环烷基、 C_3-C_6 -环烯基、杂环烷基(其各自如对上面定义的通式(I)的化合物所定义任选被取代)来转化(如描述于J. Org. Chem., 2016, 81 (16), 第6898-6926页或 Chem. Rev., 2013, 113 (7), 第5322-5363页中的)。

[1484] 实验部分-实施例

[1485] 8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(R^2)喹啉-3-甲酰胺的合成(实施例 135、137、150、188、189、243、261、264、273)。

[1486] 步骤1

[1487] 8-(3,5-二氯苯基)-4-羟基喹啉-3-甲酸



[1489] 在氩气气氛下,向烧瓶中加入8-溴-4-羟基-喹啉-3-甲酸乙酯 (15.0 g, 50.7 mmol) (Gharat, al., WO 2013/118071)、3,5-二氯苯硼酸 (11.6 g, 60.8 mmol)、碳酸钾 (14.0 g, 101 mmol) 1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁-二氯化钡(II)二氯甲烷络合物 (1.24 g, 1.52 mmol) 和脱气的二噁烷和水5:1的混合物(190 ml)。将悬浮液在70℃下搅拌过夜。然后加入氢氧化钠水溶液(5M, 101ml, 505mmol),并将深色混合物回流6小时。随后,加入热水(110ml)、甲醇(70ml)和木炭(2.5g)并继续回流几分钟。将混合物热过滤,滤饼用甲醇/水(1:1)洗涤。在搅拌下将5M乙酸(150ml, 750mmol)缓慢加入到热滤液中以达到6-7的pH范围。加入另外90ml水,在减压下部分地除去溶剂。将悬浮液在搅拌下冷却至环境温度,然后冷却至0℃。滤出沉淀,用甲醇/水(2:1)洗涤,在MTBE中搅拌,再次滤出并在真空中干燥。

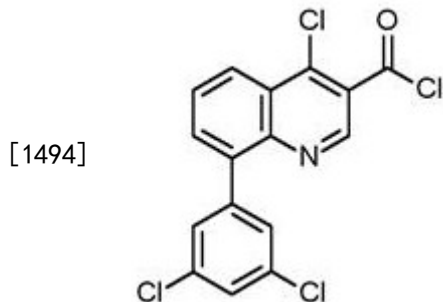
[1490] 产率: 17.5 g (92 % 纯度,理论值的95 %)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.02$ min; MS (ESIpos): $m/z = 334$ [M+H]⁺

[1491] ¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.008 (1.06), 0.008 (0.98), 1.909 (9.53), 2.524 (1.24), 2.670 (0.41), 3.162 (0.87), 3.175 (0.89), 3.568 (5.51), 7.609 (2.04), 7.628 (3.44), 7.650 (15.61), 7.654 (16.00), 7.769 (2.83), 7.773 (4.62), 7.778 (2.66), 7.788 (3.38), 7.791 (3.46), 7.806 (2.84), 7.809 (2.66), 7.874 (0.44), 7.879 (0.42), 7.948 (0.51), 7.952 (0.48), 8.364 (3.52), 8.368 (3.54), 8.385 (3.50), 8.388 (3.26), 8.603 (10.14), 12.202 (1.00).

[1492] 步骤2

[1493] 4-氯-8-(3,5-二氯苯基)喹啉-3-甲酰氯

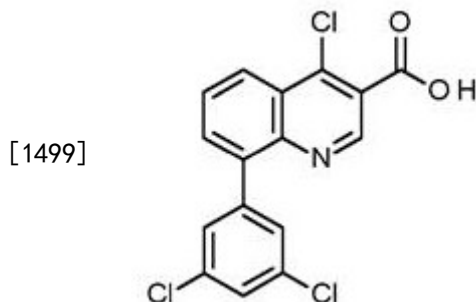


[1495] 在环境温度下,在1小时期间,在搅拌下,向8-(3,5-二氯苯基)-4-羟基喹啉-3-甲酸(步骤1)(8.10 g,24.2 mmol)在氯仿(48ml)中的悬浮液中缓慢加入DMF(4滴)和草酰氯(40 ml,460 mmol),引起显著的气体逸出。然后,将混合物缓慢加热至回流,并在回流温度下搅拌3.5小时。在减压下蒸发挥发物,将残余物与干燥的二氯甲烷共蒸发两次,与干燥的THF共蒸发一次。将粗产物(9.0g,100%)用于下一步骤中。

[1496] $^1\text{H-NMR}$ (400MHz, 氯仿 -d): δ [ppm]= 9.42 (s, 1H), 8.53 (dd, 1H), 7.89 - 7.95 (m, 1H), 7.80 - 7.87 (m, 1H), 7.53 (d, 2H), 7.46 (t, 1H).

[1497] 步骤3

[1498] 4-氯-8-(3,5-二氯苯基)喹啉-3-甲酸



[1500] 将4-氯-8-(3,5-二氯苯基)喹啉-3-甲酰氯(步骤2)(5.40 g,14.6 mmol)悬浮在THF(100ml)中。加入水(25ml)和碳酸氢钠(2.0g,23.8mmol)直至保持pH5,并将反应混合物在环境温度下搅拌过夜。在不超过40°C的浴温下,在减压下,将大部分THF除去。加入乙腈(20ml),并在减压下再次除去有机溶剂。重复该过程,将悬浮液冷却至0°C。滤出沉淀,用少量乙腈/水(2:1)和石油醚洗涤并在真空中干燥。

[1501] 产率: 5.10 g (93 % 纯度,理论值的92 %)。

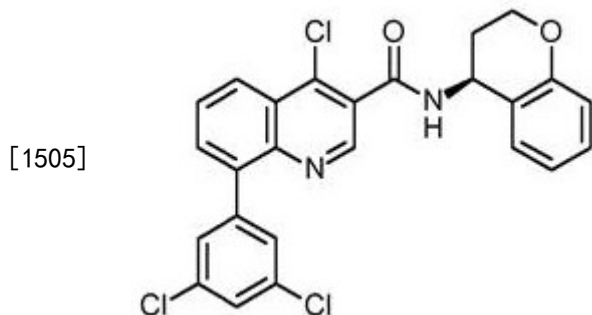
LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.16$ min; MS (ESIpos): $m/z = 352$ [M+H]⁺

[1502] $^1\text{H-NMR}$ 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.008 (1.29), 0.008 (1.20), 1.760 (0.44), 2.329 (0.64), 2.367 (0.44), 2.524 (2.38), 2.671 (0.63), 2.711 (0.43), 3.601 (0.50), 7.654 (1.72), 7.660 (4.30), 7.664 (6.77), 7.669 (16.00), 7.673 (7.64), 7.804 (1.91), 7.823 (3.49), 7.843 (3.22), 7.887 (3.53), 7.890 (3.71), 7.904 (2.79), 8.354 (3.04), 8.357 (3.11), 8.375 (2.85), 8.378 (2.73), 8.907 (6.32).

[1503] 步骤4a

[1504] 4-氯-8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺(实

实施例 4)



[1506] 在搅拌下,向4-氯-8-(3,5-二氯苯基)喹啉-3-甲酸(步骤3)(7.60 g,21.6 mmol)在THF(110 ml)中的溶液中加入(4S)-苯并二氢吡喃-4-胺盐酸盐(4.4 g,23.7mmol)、三乙胺(12ml,86mmol),并在10分钟后在环境温度下加入2,4,6-三丙基-1,3,5,2,4,6-三氧杂三磷杂环己烷 2,4,6-三氧化物(2,4,6-tripropyl-1,3,5,2,4,6-trioxatrimphosphinane 2,4,6-trioxide)在乙酸乙酯中的溶液(19ml,50%含量,32mmol),然后将混合物的温度升至36℃。在环境温度下搅拌过夜后,加入另外的(4S)-苯并二氢吡喃-4-胺盐酸盐(0.8g,4.3mmol)、三乙胺(3ml,21.5mmol)和2,4,6-三丙基-1,3,5,2,4,6-三氧杂三磷杂环己烷 2,4,6-三氧化物在乙酸乙酯中的溶液(3.85ml,50%含量,6.5mmol),并在环境温度下继续搅拌另外一夜。然后加入水,并在减压下蒸发大部分有机溶剂。滤出形成的沉淀,用石油醚洗涤,并在真空中干燥。

[1507] 产率: 10.0 g (94%纯度,理论值的90%)。

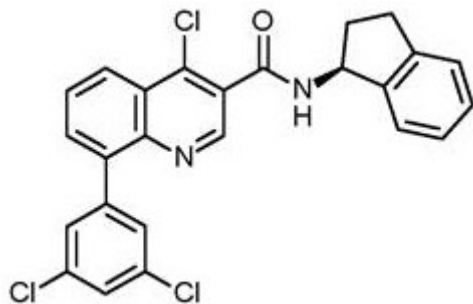
LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.35$ min; MS (ESIpos): $m/z = 483$ [M+H]⁺

[1508] ¹H-NMR 峰值列表(400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 1.356 (1.31), 1.743 (2.45), 1.752 (3.18), 1.759 (6.79), 1.768 (3.21), 1.776 (2.57), 1.988 (0.51), 2.059 (0.99), 2.066 (1.07), 2.076 (1.22), 2.084 (1.26), 2.093 (1.57), 2.100 (1.38), 2.209 (1.45), 2.221 (1.33), 2.229 (1.27), 2.242 (0.90), 2.366 (0.47), 3.585 (2.47), 3.601 (5.93), 3.617 (2.49), 4.221 (0.89), 4.241 (2.24), 4.249 (1.82), 4.262 (2.18), 4.270 (2.80), 4.279 (2.21), 4.287 (1.82), 4.296 (1.93), 4.315 (0.75), 5.267 (0.91), 5.282 (2.01), 5.301 (2.05), 5.315 (0.88), 6.791 (3.63), 6.811 (4.03), 6.917 (1.84), 6.936 (3.82), 6.955 (2.20), 7.161 (2.03), 7.179 (3.22), 7.199 (1.53), 7.380 (3.39), 7.399 (3.19), 7.680 (16.00), 7.879 (0.46), 7.893 (2.16), 7.912 (3.99), 7.932 (3.43), 8.009 (4.26), 8.026 (2.94), 8.389 (3.75), 8.410 (3.33), 8.962 (9.97), 9.251 (3.23), 9.272 (3.16).

[1509] 步骤4b

[1510] 4-氯-8-(3,5-二氯苯基)-N-[(1S)-2,3-二氢-1H-茛-1-基]喹啉-3-甲酰胺(实施例 3)

[1511]



[1512] 向搅拌的4-氯-8-(3,5-二氯苯基)喹啉-3-甲酰氯(步骤2)(480 mg, 1.29 mmol)在DMF(4ml)中的混合物中加入三乙胺(0.36ml, 2.6mmol),然后在0°C下滴加(1S)-茛满-1-胺(0.18ml, 2.6mmol)在二氯甲烷(1.2ml)中的溶液。将反应混合物在0°C下搅拌1小时,然后加热至环境温度,并用1M乙酸将pH调节至5-6,然后加入水并用二氯甲烷萃取。分离有机相并在减压下蒸发,并将残余物通过柱色谱法在硅胶(100g)上纯化,洗脱液:环己烷/乙酸乙酯(9-40%)。

[1513] 产率: 149 mg (理论值的25%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.37$ min; MS (ESIpos): $m/z = 467$ [M+H]⁺

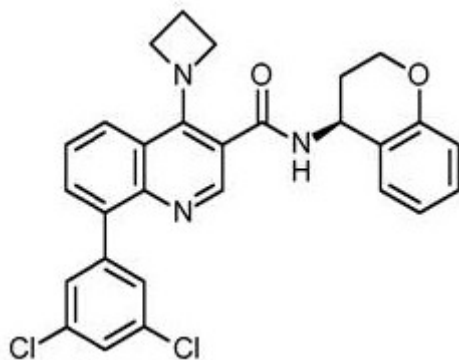
[1514]

¹H-NMR 峰值列表(400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 0.008 (1.33), 1.234 (2.20), 1.397 (0.85), 1.924 (1.63), 1.935 (0.83), 1.946 (1.76), 1.956 (1.90), 1.967 (0.79), 1.977 (1.84), 1.998 (0.66), 2.524 (2.18), 2.567 (0.88), 2.575 (0.77), 2.838 (0.77), 2.859 (1.28), 2.878 (2.28), 2.898 (2.50), 2.918 (1.19), 2.951 (1.54), 2.959 (1.64), 2.973 (1.71), 2.980 (1.81), 2.990 (0.99), 2.999 (0.88), 3.012 (0.86), 3.020 (0.74), 3.070 (1.91), 5.542 (1.02), 5.562 (2.83), 5.582 (2.79), 5.602 (0.92), 7.223 (0.96), 7.232 (4.00), 7.240 (4.95), 7.246 (5.24), 7.254 (7.15), 7.263 (2.96), 7.271 (3.67), 7.281 (2.50), 7.293 (1.17), 7.435 (2.55), 7.446 (2.61), 7.456 (2.00), 7.635 (1.10), 7.665 (0.98), 7.678 (13.08), 7.681 (16.00), 7.686 (7.10), 7.689 (3.73), 7.695 (1.37), 7.700 (0.80), 7.895 (2.06), 7.913 (4.25), 7.934 (3.06), 8.004 (4.66), 8.008 (3.27), 8.022 (3.28), 8.026 (2.07), 8.393 (4.14), 8.396 (2.75), 8.414 (3.73), 8.417 (2.39), 8.962 (10.00), 9.118 (3.31), 9.139 (3.23).

[1515] 步骤5

[1516] 4-(氮杂环丁烷-1-基)-8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺(实施例 135)

[1517]



[1518] 在厚壁微波容器中,将三乙胺(84 μ l, 0.6mmol)和氮杂环丁烷(40 μ l, 0.6mmol)加入到4-氯-8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺(步骤4a)

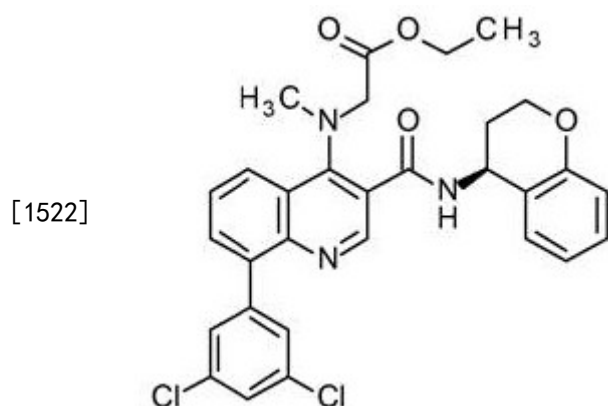
(145 mg, 0.3 mmol) 在 *N*-甲基吡咯烷酮中的溶液中。盖上容器,并在搅拌下加热至 100°C 保持 2.5 小时。将 5M 甲酸 (180 μl, 0.9 mmol) 和少量 DMSO 加入到深色混合物中,并通过制备用 HPLC (C18, 梯度: 0.1% 甲酸水溶液/乙腈) 纯化该溶液。

[1519] 产率: 93 mg (理论值的 62%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 0.89$ min; MS (ESIpos): $m/z = 504$ [M+H]⁺

¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.008 (6.30), 0.008 (2.98), 2.004 (1.02), 2.014 (0.94), 2.026 (1.43), 2.041 (1.28), 2.126 (1.31), 2.141 (1.56), 2.373 (2.15), 2.394 (2.92), 2.412 (2.16), 2.433 (1.25), 2.519 (4.80), 2.523 (4.67), 4.243 (3.28), 4.255 (4.75), 4.261 (3.01), 4.270 (2.58), 4.427 (5.50), 4.446 (8.06), 4.466 (4.62), 5.160 (0.92), 5.174 (1.75), 5.194 (1.64), [1520] 5.754 (2.42), 6.781 (3.04), 6.785 (3.14), 6.802 (3.39), 6.805 (3.26), 6.887 (1.73), 6.890 (1.66), 6.906 (3.30), 6.909 (2.99), 6.924 (1.93), 6.927 (1.70), 7.142 (1.75), 7.146 (1.77), 7.163 (2.63), 7.180 (1.31), 7.185 (1.20), 7.291 (2.83), 7.311 (2.52), 7.434 (2.40), 7.452 (3.13), 7.455 (2.90), 7.473 (2.61), 7.592 (2.65), 7.597 (4.87), 7.602 (5.82), 7.611 (16.00), 7.616 (8.48), 7.698 (3.62), 7.701 (3.63), 7.716 (3.07), 7.719 (2.82), 8.058 (3.06), 8.061 (3.05), 8.080 (2.76), 8.083 (2.47), 8.430 (11.34), 8.946 (2.94), 8.966 (2.74).

[1521] *N*-{8-(3,5-二氯苯基)-3-[(4*S*)-3,4-二氢-2*H*-色烯-4-基氨基甲酰基]喹啉-4-基}-*N*-甲基甘氨酸乙酯 (实施例 137)



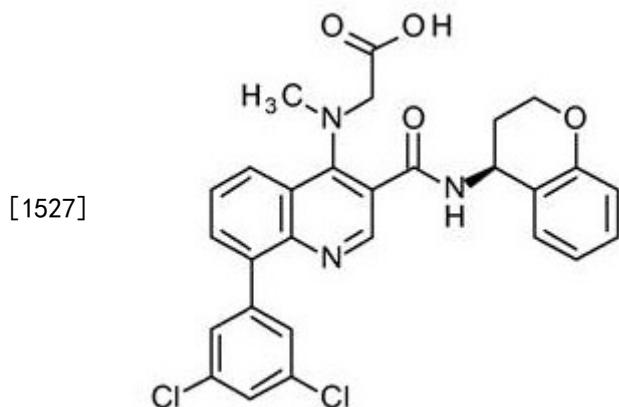
[1523] 在氩气气氛下,在厚壁微波容器中加入 1,4-二氮杂双环(2.2.2)辛烷 (56 mg, 0.5 mmol)、*N*-甲基甘氨酸乙酯盐酸盐 (1:1) (154 mg, 1.0 mmol)、*N,N*-二异丙基乙胺 (350 μl, 2.0 mmol)、*N*-甲基吡咯烷酮 (0.8 ml) 和 4-氯-8-(3,5-二氯苯基)-*N*-[(4*S*)-3,4-二氢-2*H*-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺 (步骤 4a) (242 mg, 0.5 mmol)。盖上容器,将混合物在 100°C 下在搅拌下加热 3 小时。加入进一步量的 *N*-甲基甘氨酸乙酯盐酸盐 (1:1) (77 mg, 0.5 mmol)、*N,N*-二异丙基乙胺 (170 μl, 1.0 mmol), 并继续加热 2 小时。加入 5M 甲酸 (0.7 ml, 3.5 mmol) 和 DMSO (3 ml), 并通过制备用 HPLC (C18, 梯度: 0.1% 甲酸水溶液/乙腈) 纯化该溶液。

[1524] 产率: 150 mg (98% 纯度, 理论值的 52%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.38$ min; MS (ESIpos): $m/z = 564$ [M+H]⁺

[1525] ¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.008 (0.78), 0.008 (0.70), 1.199 (4.33), 1.217 (9.13), 1.234 (4.62), 1.356 (0.52), 2.063 (0.43), 2.073 (0.48), 2.084 (0.47), 2.099 (0.71), 2.107 (0.59), 2.114 (0.45), 2.193 (0.49), 2.205 (0.59), 2.216 (0.59), 2.227 (0.52), 2.523 (0.52), 3.049 (12.82), 4.052 (6.68), 4.134 (1.34), 4.152 (4.12), 4.170 (4.04), 4.187 (1.27), 4.255 (1.01), 4.267 (1.21), 4.278 (1.65), 4.282 (1.70), 4.293 (0.97), 5.257 (0.42), 5.271 (0.95), 5.291 (0.95), 5.305 (0.42), 6.792 (1.74), 6.812 (1.94), 6.901 (0.87), 6.919 (1.84), 6.937 (1.07), 7.154 (0.86), 7.157 (0.93), 7.175 (1.47), 7.193 (0.70), 7.196 (0.71), 7.362 (1.56), 7.380 (1.46), 7.645 (16.00), 7.688 (1.26), 7.707 (1.75), 7.728 (1.59), 7.840 (1.89), 7.842 (2.05), 7.857 (1.58), 7.860 (1.56), 8.354 (1.72), 8.357 (1.80), 8.376 (1.63), 8.379 (1.60), 8.757 (6.02), 9.197 (1.69), 9.217 (1.64).

[1526] N-{8-(3,5-二氯苯基)-3-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基氨基甲酰基]喹啉-4-基}-N-甲基甘氨酸 (实施例 150)



[1528] 在环境温度下,将N-{8-(3,5-二氯苯基)-3-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基氨基甲酰基]喹啉-4-基}-N-甲基甘氨酸乙酯 (得自实施例 137) (35 mg, 62 μ mol) 在THF (0.3ml)、乙醇 (0.3ml) 和5M氢氧化钠水溶液 (50 μ l, 250 μ mol) 中搅拌1.5小时。通过加入5M甲酸将反应混合物酸化至pH3,并在减压下蒸发部分溶剂。滤出形成的沉淀,用水洗涤并在真空中干燥。

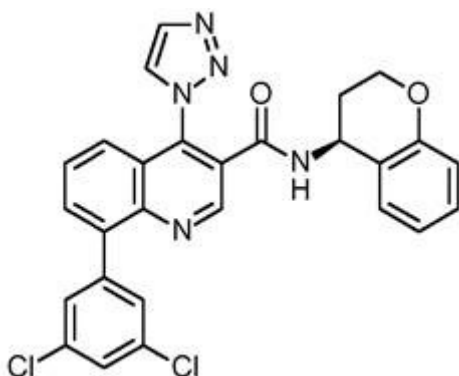
[1529] 产率: 27 mg (理论值的81%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.11$ min; MS (ESIpos): $m/z = 536$ [M+H]⁺

[1530] ¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 2.132 (1.28), 2.205 (1.37), 2.328 (0.59), 3.040 (16.00), 3.931 (0.61), 3.975 (4.59), 3.984 (4.71), 4.281 (3.48), 5.309 (1.69), 5.326 (1.68), 6.779 (2.78), 6.799 (3.08), 6.883 (1.42), 6.901 (2.80), 6.920 (1.72), 7.140 (1.56), 7.159 (2.50), 7.175 (1.25), 7.348 (2.66), 7.365 (2.47), 7.643 (14.76), 7.660 (2.25), 7.678 (2.82), 7.699 (1.88), 7.820 (3.02), 7.835 (2.42), 8.139 (1.05), 8.304 (2.56), 8.326 (2.33), 8.755 (6.56).

[1531] 8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(1H-1,2,3-三唑-1-基)喹啉-3-甲酰胺 (实施例 188)

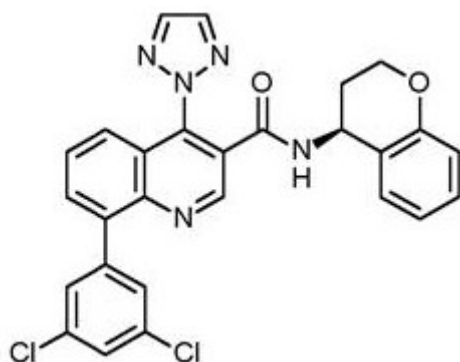
[1532]



[1533] 和

[1534] 8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(2H-1,2,3-三唑-2-基)喹啉-3-甲酰胺 (实施例 189)

[1535]



[1536] 在厚壁微波容器中加入4-氯-8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺 (步骤4a) (145 mg, 0.3 mmol)、1,2,3-三唑 (62mg, 0.9mmol)、N-甲基吡咯烷酮 (0.5ml)、三乙胺 (84μl, 0.6mmol) 和碳酸铯 (98mg, 0.3mmol)。盖上容器, 将混合物在搅拌下在100℃下加热2小时。加入5M甲酸 (240μl, 1.2mmol) 和水 (1.5ml), 滤出沉淀并弃去。通过制备用HPLC (C18, 梯度: 0.1%甲酸水溶液/乙腈) 纯化滤液。

[1537] 产率 (实施例 188): 23 mg (理论值的15%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.18$ min; MS (ESI^{neg}): $m/z = 514$ [M-H]⁻

[1538] ¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆): δ [ppm] = 9.23 (s, 1H), 9.12 (d, 1H), 8.65 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.06 (dd, 1H), 7.80 - 7.88 (m, 1H), 7.68 - 7.76 (m, 3H), 7.39 - 7.46 (m, 1H), 7.10 - 7.20 (m, 1H), 7.06 (d, 1H), 6.82 - 6.92 (m, 1H), 6.76 (d, 1H), 4.98 - 5.09 (m, 1H), 4.18 (td, 1H), 4.00 - 4.12 (m, 1H), 2.02 (br dd, 1H), 1.73 - 1.86 (m, 1H).

[1539] 产率 (实施例 189): 73 mg (97% 纯度, 理论值的46%)。

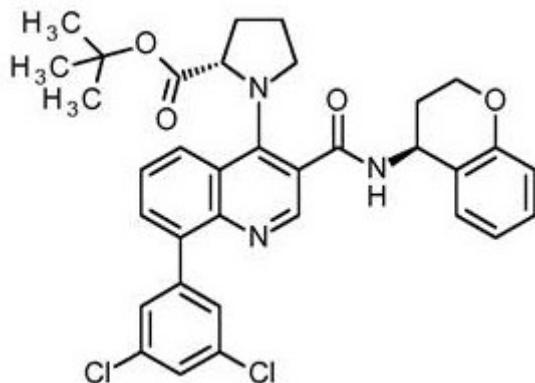
LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.27$ min; MS (ESI^{pos}): $m/z = 516$ [M+H]⁺

[1540] ¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆): 位移 [ppm] = 9.12 - 9.22 (m, 2H), 8.35 (s, 2H), 8.03 (dd, 1H), 7.87 - 7.96 (m, 1H), 7.78 - 7.87 (m, 1H), 7.66 - 7.76 (m, 2H), 7.25 (d, 1H), 7.10 - 7.19 (m, 1H), 6.88 - 6.98 (m, 1H), 6.76 (d, 1H), 4.98 - 5.14 (m, 1H), 4.07 - 4.29 (m, 2H), 2.02 - 2.14 (m, 1H), 1.94 (dtd, 1H).

[1541] 1-{8-(3,5-二氯苯基)-3-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基氨基甲酰基]喹啉-4-

基}-L-脯氨酸叔丁基酯 (实施例 243)

[1542]



[1543] 根据实施例137的方法,通过在100℃加热3小时由4-氯-8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺 (步骤4a) (242 mg, 0.5 mmol) 和L-脯氨酸叔丁基酯 (171 mg, 1.0 mmol) 合成标题化合物。

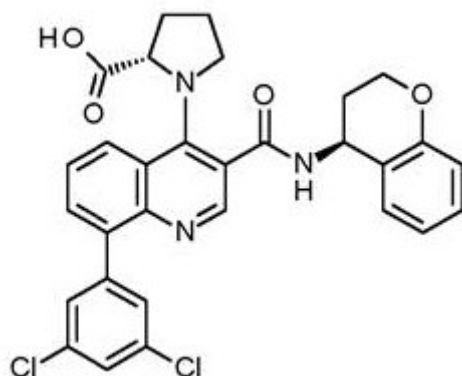
[1544] 产率: 185 mg (理论值的60%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.39$ min; MS (ESIpos): $m/z = 618$ [M+H]⁺

[1545] ¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 1.198 (16.00), 1.918 (0.63), 1.932 (0.85), 1.945 (0.51), 4.260 (0.44), 6.788 (0.61), 6.808 (0.69), 6.939 (0.64), 7.186 (0.52), 7.394 (0.55), 7.412 (0.51), 7.638 (5.73), 7.655 (0.62), 7.676 (0.53), 7.815 (0.70), 7.832 (0.56), 8.315 (0.60), 8.334 (0.55), 8.684 (2.06), 9.236 (0.58), 9.257 (0.57).

[1546] 1-{8-(3,5-二氯苯基)-3-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基氨基甲酰基]喹啉-4-基}-L-脯氨酸 (实施例 261)

[1547]



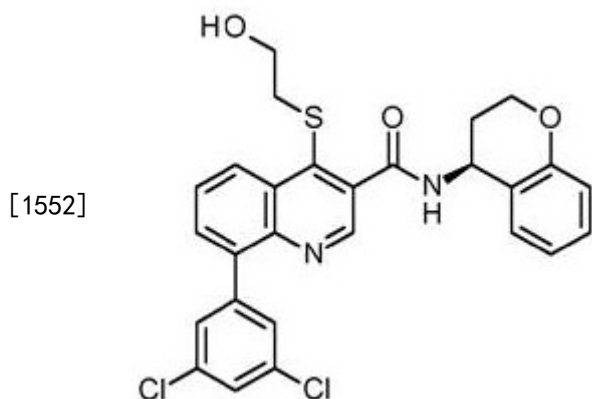
[1548] 将氯化氢在二噁烷 (1ml, 4M) 中的溶液加入到1-{8-(3,5-二氯苯基)-3-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基氨基甲酰基]喹啉-4-基}-L-脯氨酸叔丁基酯 (得自实施例 243) (155 mg, 0.25 mmol) 在二氯甲烷 (0.8 ml) 溶液中的溶液中,并在环境温度下搅拌过夜。在减压下除去挥发物,并将残余物用二氯甲烷和水搅拌。分离的水相用二氯甲烷萃取,将合并的有机相干燥并蒸发。通过制备用HPLC (C18, 梯度: 0.1% 甲酸水溶液/乙腈) 纯化残余物。

[1549] 产率: 52 mg (理论值的37%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 0.91$ min; MS (ESIpos): $m/z = 562$ [M+H]⁺

[1550] ¹H-NMR 峰值列表 (500 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.007 (3.09), 0.006 (1.99), 1.907 (2.42), 2.028 (0.58), 2.033 (0.60), 2.044 (0.71), 2.056 (0.83), 2.166 (0.52), 2.175 (0.71), 2.185 (0.75), 2.193 (0.77), 2.204 (0.50), 2.358 (0.89), 2.361 (1.22), 2.365 (0.93), 2.369 (0.58), 2.392 (0.70), 2.407 (0.71), 2.514 (3.50), 2.518 (3.01), 2.522 (2.34), 2.631 (0.87), 2.635 (1.14), 2.639 (0.81), 3.866 (0.46), 3.878 (1.06), 3.895 (0.91), 4.183 (0.43), 4.188 (0.44), 4.205 (1.12), 4.224 (0.89), 4.229 (0.73), 4.243 (0.75), 4.250 (1.08), 4.262 (0.91), 4.277 (0.46), 4.638 (0.83), 4.649 (1.02), 4.654 (1.33), 4.665 (1.06), 5.254 (0.54), 5.264 (1.14), 5.280 (1.10), 5.291 (0.50), 6.786 (2.22), 6.788 (2.18), 6.802 (2.42), 6.804 (2.32), 6.919 (1.16), 6.921 (1.08), 6.933 (2.26), 6.935 (2.11), 6.948 (1.31), 6.950 (1.18), 7.169 (1.12), 7.172 (1.16), 7.186 (1.76), 7.200 (0.93), 7.203 (0.89), 7.388 (1.80), 7.403 (1.70), 7.629 (1.72), 7.634 (4.02), 7.637 (8.89), 7.639 (16.00), 7.642 (4.87), 7.652 (2.18), 7.654 (1.91), 7.669 (1.82), 7.806 (2.51), 7.809 (2.42), 7.821 (2.05), 7.823 (1.86), 8.303 (1.86), 8.320 (1.72), 8.680 (8.25), 12.586 (0.91).

[1551] 8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-[(2-羟基乙基)硫烷基]喹啉-3-甲酰胺 (实施例 264)



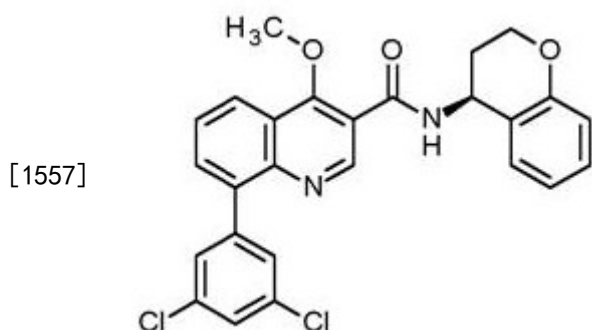
[1553] 在厚壁容器中加入4-氯-8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺 (步骤4a) (121 mg, 250 μ mol)、DMSO (0.3 ml)、2-硫烷基乙醇 (39 mg, 500 μ mol) 和三乙胺 (87 μ l, 630 μ mol), 加盖并在100 $^{\circ}$ C下加热2小时。冷却至环境温度后, 加入5M甲酸 (300 μ l, 1.5 mmol), 通过加入乙腈使混合物溶解并通过制备用HPLC (C18, 梯度: 0.1%甲酸水溶液/乙腈) 纯化。

[1554] 产率: 95 mg (理论值的72%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.28$ min; MS (ESIpos): $m/z = 525$ [M+H]⁺

¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.008 (2.66), 0.008 (2.57), 2.119 (1.04), 2.128 (0.86), 2.366 (0.82), 2.710 (0.82), 3.060 (2.72), 3.077 (6.64), 3.093 (3.50), 3.287 (2.70), 3.438 (1.04), 3.454 (2.48), 3.468 (3.16), 3.481 (2.10), 3.497 (0.89), 4.254 (1.46), 4.263 (1.26), 4.273 (2.24), 4.282 (2.43), 4.297 (1.35), 4.946 (2.06), 4.960 (4.56), 4.974 (1.99), 5.291 (1.28), [1555] 5.310 (1.31), 6.781 (2.41), 6.784 (2.61), 6.802 (2.74), 6.805 (2.88), 6.910 (1.33), 6.913 (1.46), 6.928 (2.63), 6.932 (2.57), 6.947 (1.59), 6.950 (1.53), 7.151 (1.31), 7.156 (1.35), 7.173 (2.21), 7.190 (1.24), 7.194 (1.13), 7.448 (2.17), 7.465 (2.06), 7.627 (1.00), 7.632 (1.04), 7.658 (5.73), 7.662 (16.00), 7.666 (6.68), 7.669 (3.41), 7.675 (1.22), 7.838 (1.93), 7.856 (2.97), 7.859 (2.35), 7.877 (2.92), 7.929 (3.21), 7.932 (3.50), 7.946 (2.21), 7.950 (2.06), 8.624 (2.97), 8.627 (2.97), 8.645 (2.70), 8.649 (2.50), 8.881 (10.45), 9.155 (2.48), 9.175 (2.37).

[1556] 8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-甲氧基喹啉-3-甲酰胺 (实施例 373)



[1558] 在氩气气氛下,将甲醇钠在甲醇中的溶液(140 μ l, 5.4M, 780 μ mol)滴加到4-氯-8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺(步骤4a)(150 mg, 310 μ mol)在N-甲基吡咯烷酮(1 ml)中的溶液中,并将该混合物在环境温度下搅拌40分钟。加入乙酸(250 μ l, 5.0M, 1.2mmol),并通过制备用HPLC(C18,梯度:0.1%甲酸水溶液/乙腈)纯化混合物。

[1559] 产率: 94 mg (理论值的63%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.39$ min; MS (ESIpos): $m/z = 479$ [M+H]⁺

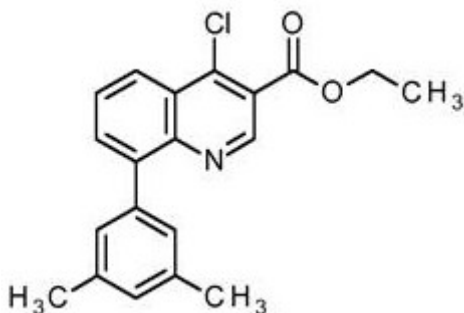
¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 4.172 (16.00), 4.245 (0.90), 4.254 (1.07), 4.269 (1.49), 4.273 (1.51), 4.283 (0.86), 5.274 (0.83), 5.293 (0.83), 5.754 (12.35), 6.793 (1.40), [1560] 6.796 (1.53), 6.814 (1.59), 6.816 (1.66), 6.909 (0.74), 6.912 (0.74), 6.928 (1.55), 6.930 (1.54), 6.946 (0.93), 6.949 (0.91), 7.159 (0.76), 7.163 (0.82), 7.180 (1.29), 7.363 (1.33), 7.380 (1.25), 7.650 (0.88), 7.655 (2.07), 7.659 (2.33), 7.670 (7.40), 7.675 (4.39), 7.702 (1.20), 7.720 (1.66), 7.723 (1.57), 7.741 (1.47), 7.886 (1.69), 7.890 (1.80), 7.904 (1.44), 7.908 (1.42), 8.296 (1.61), 8.299 (1.63), 8.317 (1.54), 8.320 (1.45), 8.811 (5.57), 9.192 (1.36), 9.212 (1.34).

[1561] 4-氯-8-(3,5-二甲基苯基)-N-[(1S)-1,2,3,4-四氢萘-1-基]喹啉-3-甲酰胺的合成(实施例 1)。

[1562] 步骤1

[1563] 4-氯-8-(3,5-二甲基苯基)喹啉-3-甲酸乙酯

[1564]



[1565] 在氩气气氛下,向烧瓶中加入8-溴-4-氯喹啉-3-甲酸乙酯 (330 mg,1.05 mmol) (Zask,al.Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters,2003,1487-1490; Laxmikant,al. US2013/210844)、3,5-二甲基苯硼酸(189mg,1.26mmol)和脱气的二噁烷(6.6ml)和水1.3ml)的混合物。然后加入碳酸钾(290mg,2.10mmol)和1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁-二氯化钡(II)二氯甲烷络合物(42.8 mg,52.5 μmol),并将混合物在50 $^{\circ}\text{C}$ 下搅拌过夜。将反应混合物通过硅藻土过滤并用乙酸乙酯和水洗涤。滤液的有机相用水和盐水洗涤,经硫酸钠干燥并在减压下蒸发。通过制备用HPLC(C18,梯度:0.1%甲酸水溶液/乙腈)和硅胶色谱(环己烷/乙酸乙酯-5:1)纯化残余物。

[1566] 产率: 77.0 mg (理论值的21%)。

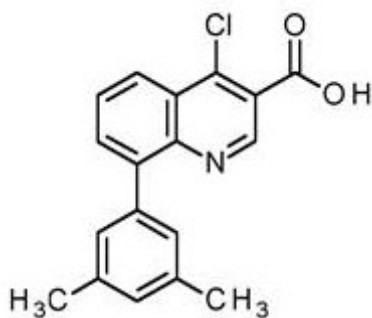
LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.43$ min; MS (ESIpos): $m/z = 340$ [M+H]⁺

[1567] NMR: ¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆): δ [ppm]= 9.13 (s, 1H), 8.42 (dd, 1H), 7.87 - 7.96 (m, 2H), 7.20 (s, 2H), 7.07 (s, 1H), 4.44 (q, 2H), 2.35 (s, 6H), 1.38 (t, 3H).

[1568] 步骤2

[1569] 4-氯-8-(3,5-二甲基苯基)喹啉-3-甲酸

[1570]



[1571] 向0.5ml乙醇和0.5ml THF中的4-氯-8-(3,5-二甲基苯基)喹啉-3-甲酸乙酯 (步骤1) (84.0 mg,247 μmol)中加入氢氧化钠水溶液(5 M,150 μl ,740 μmol),并将混合物在环境温度下搅拌过夜。在减压下除去溶剂,将残余物溶于DMSO和5M甲酸中,并通过制备用HPLC(C18,梯度:0.1%甲酸水溶液/乙腈)纯化,得到灰白色固体。

[1572] 产率: 75.0 mg (理论值的97%)。

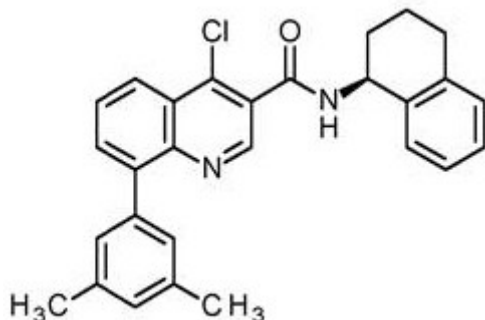
LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.15$ min; MS (ESIpos): $m/z = 312$ [M+H]⁺

[1573] ¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 2.346 (16.00), 7.062 (1.52), 7.189 (3.52), 7.884 (1.52), 7.895 (1.68), 7.902 (3.49), 8.396 (0.99), 8.403 (0.92), 8.414 (0.88), 8.421 (0.87), 9.116 (2.83).

[1574] 步骤3

[1575] 4-氯-8-(3,5-二甲基苯基)-N-[(1S)-1,2,3,4-四氢萘-1-基]喹啉-3-甲酰胺 (实施例 1)

[1576]



[1577] 用(1S)-1,2,3,4-四氢萘-1-胺 (36.9 mg, 251 μmol) 和三乙胺 (190 μl , 1.4 mmol) 处理在 1.2 ml THF 中的 4-氯-8-(3,5-二甲基苯基)喹啉-3-甲酸 (步骤 2) (71.0 mg, 228 μmol), 并在 60 $^{\circ}\text{C}$ 下搅拌 10 分钟。然后加入 2,4,6-三丙基-1,3,5,2,4,6-三氧杂三磷杂环己烷 2,4,6-三氧化物在乙酸乙酯中的溶液 (200 μl , 50% 含量, 340 μmol), 除去加热, 并将混合物在环境温度下搅拌过夜。加入水和 5M 甲酸 (0.6 ml), 在减压下除去溶剂。通过制备用 HPLC (C18, 梯度: 0.1% 甲酸水溶液/乙腈) 纯化残余物。

[1578] 产率: 20.0 mg (理论值的 20%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.42 \text{ min}$; MS (ESIpos): $m/z = 441 [M+H]^+$

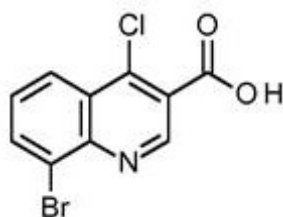
[1579] $^1\text{H-NMR}$ 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d_6) δ [ppm]: -0.008 (4.41), 0.008 (4.06), 2.342 (16.00), 2.759 (1.07), 7.059 (1.60), 7.111 (0.66), 7.128 (1.05), 7.183 (4.61), 7.195 (1.69), 7.202 (0.82), 7.207 (0.96), 7.422 (0.89), 7.438 (0.75), 7.855 (4.02), 7.865 (2.24), 7.869 (2.26), 8.303 (1.26), 8.314 (1.10), 8.317 (1.07), 8.328 (1.10), 8.874 (5.11), 9.102 (0.96), 9.123 (0.96).

[1580] 8-(2,3-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(吗啉-4-基)喹啉-3-甲酰胺的合成 (实施例 52)。

[1581] 步骤 1

[1582] 8-溴-4-氯喹啉-3-甲酸

[1583]



[1584] 向 8-溴-4-氯喹啉-3-甲酸乙酯 (9.44 g, 30.0 mmol) 在 THF (65 ml) 中的悬浮液中加入氢氧化钠水溶液 (12 ml, 10M, 120 mmol), 并在环境温度下强烈搅拌混合物。5 小时后, 加入水 (12 ml), 将混合物在环境温度下搅拌过夜。从在烧瓶壁上形成的无定形沉淀中滗去上清液并弃去。将沉淀在真空中干燥, 得到标题化合物的钠盐。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 0.70$ min; MS (ESIpos): $m/z = 285$ [M+H]⁺

[1585] ¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆): δ [ppm] = 8.98 (s, 1H), 8.29 (dd, 1H), 8.16 - 8.23 (m, 1H), 7.64 (t, 1H).

[1586] 将剩余的湿固体在60℃下溶于水(250ml)中,并在剧烈搅拌下加入甲酸(57ml, 5.0M, 280mmol),得到pH值为3并形成沉淀。将混合物冷却至环境温度,滤出沉淀,用水洗涤并在40℃下在真空中干燥。

[1587] 产率: 7.0 g (98 % 纯度,理论值的80 %)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 0.70$ min; MS (ESIpos): $m/z = 285$ [M+H]⁺

[1588] ¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆): δ [ppm] = 14.12 (br s, 1H), 9.25 (s, 1H), 8.42 (d, 1H), 8.36 (d, 1H), 7.75 (t, 1H).

[1589] 步骤2

[1590] 8-溴-4-氯-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺



[1592] 通过在50℃的油浴中搅拌10分钟,将8-溴-4-氯喹啉-3-甲酸(步骤1)(7.00g, 24.4mmol)溶解在THF中。除去加热,加入(4S)-苯并二氢吡喃-4-胺盐酸盐(5.44g, 29.3mmol)、N,N-二异丙基乙胺(17ml, 98mmol)和2,4,6-三丙基-1,3,5,2,4,6-三氧杂三磷杂环己烷 2,4,6-三氧化物在乙酸乙酯中的溶液(23ml, 50%含量, 39mmol),这导致温度升至45℃。继续搅拌30分钟,并在连续搅拌下加入水(300ml)以支持固体沉淀。收集沉淀,用水洗涤并在真空中干燥。

[1593] 产率: 9.50 g (理论值的93 %)。

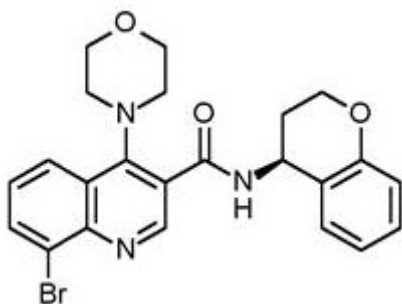
LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.01$ min; MS (ESI_{neg}): $m/z = 417$ [M+H]⁻

[1594] ¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 2.047 (0.74), 2.054 (0.99), 2.063 (1.54), 2.070 (1.66), 2.081 (1.85), 2.088 (1.86), 2.097 (2.49), 2.104 (2.18), 2.113 (1.49), 2.120 (1.08), 2.197 (1.06), 2.206 (1.61), 2.218 (2.41), 2.231 (2.17), 2.239 (2.10), 2.252 (1.56), 2.264 (1.01), 2.273 (0.71), 2.328 (0.42), 2.670 (0.47), 4.205 (1.18), 4.212 (1.43), 4.233 (3.76), 4.240 (2.80), 4.253 (3.08), 4.261 (2.42), 4.277 (2.42), 4.285 (3.12), 4.293 (2.75), 4.302 (3.10), 4.313 (1.33), 4.321 (1.40), 4.329 (1.04), 5.266 (1.51), 5.281 (3.35), 5.300 (3.35), 5.315 (1.47), 6.793 (5.60), 6.814 (6.35), 6.922 (2.99), 6.940 (6.44), 6.959 (3.78), 7.162 (3.04), 7.165 (3.11), 7.183 (5.15), 7.201 (2.48), 7.382 (5.42), 7.401 (5.04), 7.713 (4.62), 7.733 (8.03), 7.754 (5.29), 8.312 (6.79), 8.324 (8.26), 8.327 (8.69), 8.345 (6.64), 9.042 (16.00), 9.264 (4.77), 9.285 (4.67).

[1595] 步骤3

[1596] 8-溴-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(吗啉-4-基)喹啉-3-甲酰胺

[1597]



[1598] 向8-溴-4-氯-N-[(4S) -3,4-二氢-2H-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺 (步骤2) (9.50 g, 22.7 mmol) 在THF (70 ml) 中的溶液中加入吗啉(6.0ml, 68mmol) 和1,4-二氮杂双环[2.2.2]辛烷(2.55g, 22.7mmol), 并在80°C浴温下搅拌1.5小时。加入水(30ml), 在减压下蒸发THF。加入更多的水, 并首先在50°C下然后在环境温度下搅拌悬浮液。滤出沉淀, 用水洗涤并在真空中干燥。

[1599] 产率: 10.5 g (理论值的98%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 0.92$ min; MS (ESI^{neg}): $m/z = 466$ [M-H]⁻

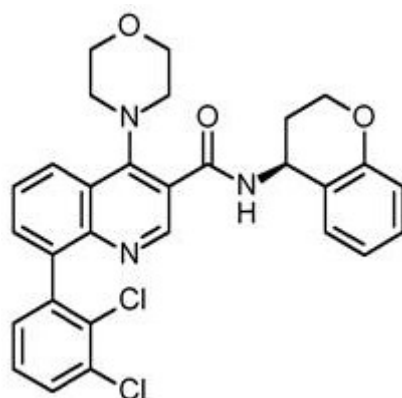
¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.149 (0.41), -0.008 (4.42), 0.008 (3.18), 2.041 (0.54), 2.048 (0.76), 2.056 (1.13), 2.063 (1.19), 2.076 (1.30), 2.091 (1.80), 2.098 (1.57), 2.106 (1.11), 2.197 (0.74), 2.206 (1.17), 2.218 (1.70), 2.231 (1.59), 2.240 (1.58), 2.253 (1.13), 2.262 (0.74), 2.274 (0.52), 2.327 (0.60), 2.366 (0.49), 2.523 (2.30), 2.669 (0.66), 2.710 (0.48), 3.217 (0.69), 3.228 (1.18), 3.248 (4.71), 3.258 (11.00), 3.269 (11.28), 3.279 (5.00), 3.842 (8.92), 3.853 (14.13), 3.864 (8.07), 4.214 (0.80), 4.221 (1.01), 4.242 (2.68), 4.249 (2.03), 4.263 (2.41), 4.271 (2.08), 4.276 (2.00), 4.286 (2.44), 4.293 (2.07), 4.302 (2.18), 4.314 (0.86), 4.321 (0.96), 4.329 (0.65), 5.245 (1.10), 5.259 (2.45), 5.279 (2.44), 5.292 (1.06), 6.797 (4.29), 6.815 (4.84), 6.927 (2.26), 6.929 (2.16), 6.946 (4.75), 6.964 (2.87), 7.164 (2.33), 7.167 (2.40), 7.185 (3.85), 7.202 (1.91), 7.206 (1.79), 7.385 (4.05), 7.403 (3.77), 7.499 (3.74), 7.518 (5.40), 7.538 (4.06), 8.123 (4.80), 8.125 (5.04), 8.142 (4.71), 8.144 (4.51), 8.197 (4.92), 8.199 (4.64), 8.218 (4.71), 8.753 (16.00), 9.177 (3.99), 9.197 (3.89).

[1600]

[1601] 步骤4

[1602] 8-(2,3-二氯苯基)-N-[(4S) -3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(吗啉-4-基)喹啉-3-甲酰胺 (实施例 52)

[1603]



[1604] 在氩气气氛下, 通过超声波处理将碳酸钾(1.29g, 9.31mmol) 溶解在脱气的5:1二

噁烷和水(21ml)的混合物中。加入1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁-二氯化钿(II)二氯甲烷络合物(190 mg, 0.23 mmol)和8-溴-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(吗啉-4-基)喹啉-3-甲酰胺(步骤3)(2.18 g, 4.65 mmol), 然后加入2,3-二氯苯硼酸(977 mg, 5.12 mmol)。关闭容器, 并在80°C浴温下搅拌2.5小时。加入水, 混合物用乙酸乙酯萃取。将有机相干燥并在减压下蒸发。通过柱色谱法在硅胶(10g)上纯化残余物, 洗脱液: 环己烷/乙酸乙酯(15-35%)。将得到的固体在MTBE(30ml)和甲醇(1.5ml)的混合物中搅拌, 滤出并在真空中干燥。

[1605] 产率: 2.03 g (理论值的82%)。

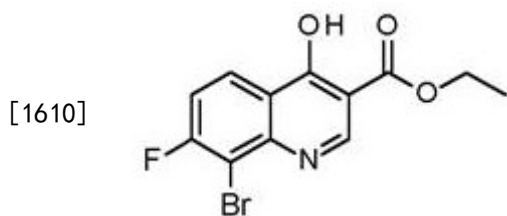
LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.13$ min; MS (ESIpos): $m/z = 534$ [M+H]⁺

[1606] ¹H-NMR 峰值列表 (600 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 2.056 (0.40), 2.199 (0.43), 2.208 (0.44), 2.214 (0.44), 3.269 (0.65), 3.280 (1.04), 3.289 (1.15), 3.300 (1.36), 3.307 (1.17), 3.321 (0.61), 3.335 (16.00), 4.233 (0.78), 4.237 (0.53), 4.247 (0.59), 4.251 (0.49), 4.261 (0.49), 4.267 (0.62), 4.272 (0.54), 4.278 (0.63), 5.239 (0.42), 5.246 (0.54), 5.260 (0.42), 6.781 (1.24), 6.794 (1.32), 6.911 (0.70), 6.915 (0.74), 6.928 (0.40), 7.150 (0.59), 7.162 (0.96), 7.175 (0.49), 7.310 (0.47), 7.312 (0.47), 7.323 (0.59), 7.324 (0.57), 7.336 (0.53), 7.338 (0.53), 7.348 (0.71), 7.350 (0.72), 7.357 (1.04), 7.370 (0.95), 7.420 (0.46), 7.432 (1.04), 7.445 (1.07), 7.457 (0.42), 7.664 (0.76), 7.676 (1.51), 7.690 (2.57), 7.693 (1.60), 7.704 (2.49), 7.716 (0.68), 8.281 (1.15), 8.283 (1.14), 8.295 (1.07), 8.297 (1.02), 8.588 (1.70), 8.595 (1.82), 9.166 (0.54), 9.180 (1.03), 9.195 (0.56).

[1607] 8-(3-氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(二甲基-氨基)-7-氟喹啉-3-甲酰胺的合成(实施例141)。

[1608] 步骤1

[1609] 8-溴-7-氟-4-羟基喹啉-3-甲酸乙酯



[1611] 将2-溴-3-氟苯胺(24.89g, 131mmol)和乙氧基亚甲基丙二酸二乙酯(28.33g, 131mmol, 26mL)的混合物在室温下搅拌16小时。在250°C下在真空(60 mbar)下继续搅拌6小时。使反应混合物冷却至室温。在回流的乙酸乙酯(400mL)中搅拌固体残余物。滤出沉淀并用乙酸乙酯洗涤。在乙醇(400mL)和甲醇(40mL)的回流混合物中搅拌固体。滤出热悬浮液。用乙醇洗涤固体并在空气下干燥。

[1612] 产率: 28.60 g (83 mmol, 理论值的63%)。

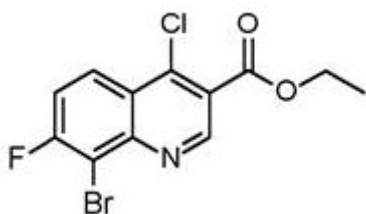
LC-MS (方法 L2): $R_t = 1.73$ min, $m/z = 314/316$ (M+H)⁺

[1613] ¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 11.78 (s, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.22 (m, 1H), 7.50 - 7.39 (m, 1H), 4.23 (d, J = 7.1 Hz, 2H), 1.28 (t, J = 7.1 Hz, 3H).

[1614] 步骤2

[1615] 8-溴-4-氯-7-氟喹啉-3-甲酸乙酯

[1616]



[1617] 向搅拌的磷酰氯(38.4g,250mmol,23mL)中加入8-溴-7-氟-4-羟基喹啉-3-甲酸乙酯(步骤1)(23.6g,75mmol)。将所得悬浮液在80℃下搅拌1小时。将混合物冷却至室温,并倒入剧烈搅拌的冰水(100mL)中。将得到的混合物在室温下静置两天。通过过滤收集沉淀并用水洗涤直至滤液为中性。将固体在乙醚和二异丙醚(1:1;1 L)的混合物中研磨。滤出固体。将滤液在25℃下在真空中浓缩。将残余物与甲苯共蒸发后,得到21.3g(64mmol,理论值的85%)标题化合物。

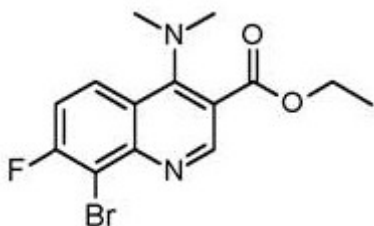
[1618] 产率: 21.3 g (64 mmol,理论值的85%)。

[1619] LC-MS (方法 L2): $R_t = 2.18 \text{ min}$, $m/z = 332/334 (M+H)^+$

[1620] 步骤3

[1621] 8-溴-4-(二甲基氨基)-7-氟喹啉-3-甲酸乙酯

[1622]



[1623] 向8-溴-4-氯-7-氟喹啉-3-甲酸乙酯(步骤2)(14.31g,43mmol)在干燥的四氢呋喃(150mL)中的溶液中加入三乙胺(8.71g,86mmol,12 mL)和二甲胺(2M在四氢呋喃中;48mmol,24mL)。将反应混合物在室温下搅拌16小时。滤出固体并用四氢呋喃洗涤。将滤液在真空中浓缩,得到标题化合物。

[1624] 产率: 12.66 g (37 mmol,理论值的86%)。

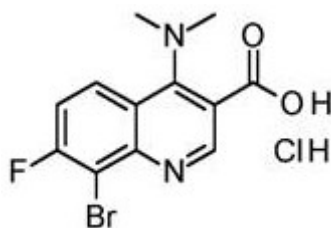
LC-MS (方法 L2): $R_t = 1.75 \text{ min}$, $m/z = 341/343 (M+H)^+$

[1625] $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.86 (s, 1H), 8.28 (dd, $J = 9.4, 6.1 \text{ Hz}$, 1H), 7.63 (dd, $J = 9.4, 8.2 \text{ Hz}$, 1H), 4.39 (q, $J = 7.1 \text{ Hz}$, 2H), 3.07 (s, 6H), 1.36 (t, $J = 7.1 \text{ Hz}$, 3H)。

[1626] 步骤4

[1627] 8-溴-4-(二甲基氨基)-7-氟喹啉-3-甲酸乙酯 盐酸盐

[1628]



[1629] 向8-溴-4-(二甲基氨基)-7-氟喹啉-3-甲酸乙酯(步骤3)(14.0 g,41 mmol)在四氢呋喃(100mL)中的溶液中加入氢氧化锂一水合物(11.5 g,274 mmol)在水(100mL)中的

溶液中。将混合物在75℃下搅拌16小时,并使其冷却至室温。分离各层,并用四氢呋喃(2×150mL)萃取水层。将合并的有机层在真空中浓缩,并加入盐酸(4M; 100mL)。滤出固体,用水和乙醚洗涤,空气干燥,得到标题化合物。

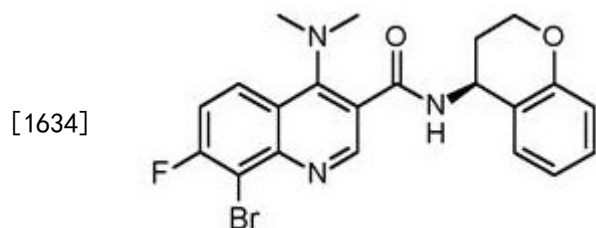
[1630] 产率: 10.6 g (30 mmol,理论值的74%)。

LC-MS (方法 L2): $R_t = 1.21$ min, $m/z = 313/315$ (M+H)⁺

[1631] ¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.73 (s, 1H), 8.41 (dd, J = 9.4, 5.7 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 9.4, 8.1 Hz, 1H), 3.35 (s, 6H) [没有检测到酸性质子]。

[1632] 步骤5

[1633] 8-溴-N-[(4S) -3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(二甲基氨基)-7-氟喹啉-3-甲酰胺



[1635] 向8-溴-4-(二甲基氨基)-7-氟喹啉-3-甲酸盐(步骤4) (2.00 g, 5.7 mmol) 在N,N-二甲基甲酰胺 (50 mL) 中的溶液中加入1-[双(二甲基氨基)-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(2.18g, 5.7mmol)和N,N-二异丙基乙胺(4.21g, 32.6mmol, 5.7mL)。将混合物在室温下搅拌1小时。加入(4S)-苯并二氢吡喃-4-胺盐酸盐(1.06g, 5.7mmol)。将反应混合物在室温下搅拌16小时。将混合物倒入水(200mL)中。滤出固体,用水洗涤并在真空中干燥。与甲苯和乙酸乙酯共蒸发后,得到标题化合物。

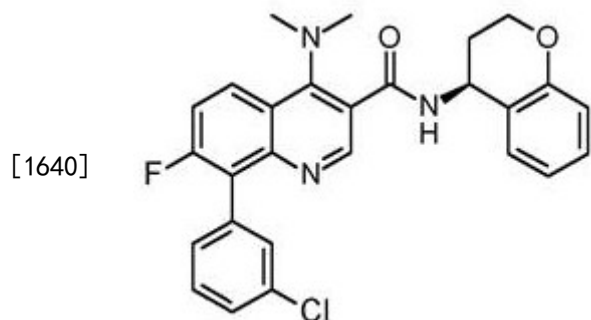
[1636] 产率: 1.90 g (4.3 mmol,理论值的75%)。

LC-MS (方法 L2): $R_t = 1.78$ min, $m/z = 444/446$ (M+H)⁺

[1637] ¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 9.12 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.70 (s, 1H), 8.23 (dd, J = 9.4, 6.1 Hz, 1H), 7.59 (dd, J = 9.3, 8.3 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.22 - 7.14 (m, 1H), 6.98 - 6.90 (m, 1H), 6.81 (dd, J = 8.2, 1.0 Hz, 1H), 5.29 - 5.20 (m, 1H), 4.34 - 4.19 (m, 2H), 3.06 (s, 6H), 2.27 - 2.15 (m, 1H), 2.11 - 2.00 (m, 1H)。

[1638] 步骤6

[1639] 8-(3-氯苯基)-N-[(4S) -3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(二甲基-氨基)-7-氟喹啉-3-甲酰胺 (实施例 141)



[1641] 在8 mL螺旋盖小瓶中,向脱气(1分钟,氮气)的8-溴-N-[(4S) -3,4-二氢-2H-色烯-

4-基]-4-(二甲基氨基)-7-氟喹啉-3-甲酰胺 (100 mg, 0.225 mmol)、(3-氯苯基)硼酸(42 mg, 0.270 mmol)和碳酸钠(72 mg, 0.675 mmol)在四氢呋喃(1.30 mL)和水(0.25 mL)中的混合物中的混合物中加入1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁二氯化钯(II)(3mg, 0.005mmol)。将反应混合物在60℃下搅拌16小时并冷却至室温。加入水(5mL),并将水层用二氯甲烷(3×3mL)通过相分离器萃取。在真空中除去溶剂。通过快速柱色谱法(庚烷,5%-35%乙酸乙酯)纯化,得到标题化合物。

[1642] 产率: 56 mg (0.118 mmol, 理论值的52%)。

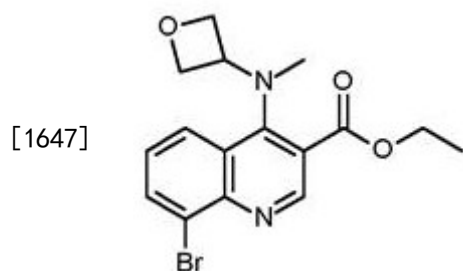
LC-MS (方法 L2): $R_t = 3.03 \text{ min}$, $m/z = 476 (M+H)^+$

[1643] $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.08 (d, $J = 8.2 \text{ Hz}$, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.27 (dd, $J = 9.4, 6.2 \text{ Hz}$, 1H), 7.60 (t, $J = 9.3 \text{ Hz}$, 1H), 7.55 - 7.45 (m, 3H), 7.43 - 7.31 (m, 2H), 7.20 - 7.12 (m, 1H), 6.95 - 6.88 (m, 1H), 6.83 - 6.76 (m, 1H), 5.28 - 5.19 (m, 1H), 4.32 - 4.19 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.25 - 2.14 (m, 1H), 2.09 - 1.98 (m, 1H).

[1644] 8-(2,3-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-[甲基(氧杂环丁烷-3-基)氨基]喹啉-3-甲酰胺的合成(实施例 331)。

[1645] 步骤1

[1646] 8-溴-4-[甲基(氧杂环丁烷-3-基)氨基]喹啉-3-甲酸乙酯



[1648] 向烧瓶中加入在40mL乙腈中的8-溴-4-氯喹啉-3-甲酸乙酯(1.26 g, 4 mmol)(Zask, al. *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters*, 2003, 1487-1490; Laxmikant, al. US2013/ 210844)、1-甲基-3-氧杂环丁胺(0.42g, 4mmol)、*N,N*-二异丙基乙胺(0.62g, 4.8mmol)。将反应混合物回流24小时。然后在减压下除去溶剂,并将剩余材料溶于乙酸乙酯中并用水洗涤两次。分离有机相,用硫酸钙干燥,过滤,并在减压下除去滤液。通过反相柱色谱法(洗脱液水/乙腈梯度)纯化得到的残余物。

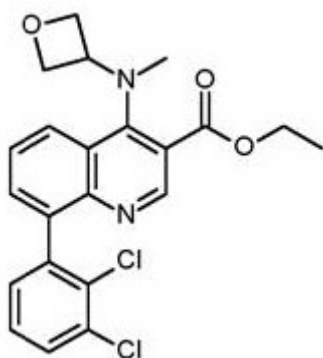
[1649] 产率: 1.2 g (3.2 mmol, 理论值的82%)。

[1650] $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.94 (s, 1H), 8.20 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 7.55 (dd, 1H), 4.72 - 4.62 (m, 5H, 氧杂环丁烷基), 4.43 - 4.38 (q, 2H), 3.10 (s, 3H), 1.37 (t, 3H).

[1651] 步骤2

[1652] 8-(2,3-二氯苯基)-4-[甲基(氧杂环丁烷-3-基)氨基]喹啉-3-甲酸乙酯

[1653]



[1654] 在微波小瓶中,向脱气(1分钟,氩气)的8-溴-4-[甲基(氧杂环丁烷-3-基)氨基]喹啉-3-甲酸乙酯(步骤1)(500 mg,1.37 mmol)、(2,3-二氯苯基)硼酸(261mg,1.37mmol)、碳酸铯(2M,1.37mL,2.74mmol)和二噁烷(12.5mL)的水溶液的混合物中加入1,1'-双(二苯基膦)二茂铁二氯化钨(II)(111mg,0.14mmol)。将反应混合物在Biotage微波炉中在100℃下处理25分钟。通过硫酸钠/硅胶筒过滤反应混合物,并通过反相色谱法(洗脱液水/乙腈梯度)纯化。

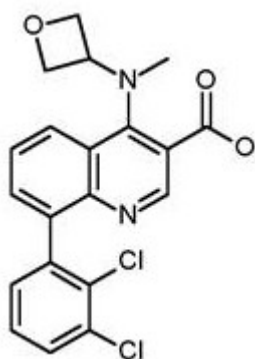
[1655] 产率: 600 mg (理论值的98%)。

[1656] $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.77 (s, 1H), 8.21 (t, 1H), 7.74 (d, 2H), 7.71 (d, 1H), 7.45 (t, 1H), 7.36 (d, 1H), 4.76 – 4.65 (m, 5H, 氧杂环丁烷基), 4.40 – 4.34 (q, 2H), 3.14 (s, 3H), 1.34 (t, 3H)。

[1657] 步骤3

[1658] 8-(2,3-二氯苯基)-4-[甲基(氧杂环丁烷-3-基)氨基]喹啉-3-甲酸

[1659]



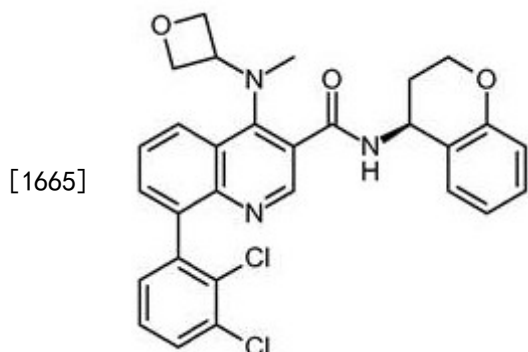
[1660] 将8-(2,3-二氯苯基)-4-[甲基(氧杂环丁烷-3-基)氨基]喹啉-3-甲酸乙酯(步骤2)(580 mg,1.34 mmol)溶于20mL二噁烷中并与在5mL水中的LiOH(35.4 mg,1.48 mmol)混合。将反应混合物在60℃下加热16小时。在减压下除去二噁烷,将剩余的溶液加入乙酸乙酯和水的混合物中。分离水相,用1N HCl处理至pH5。用乙酸乙酯萃取该酸化过的溶液两次,干燥合并的萃取液,过滤并在减压下除去溶剂。所得化合物无需进一步纯化即可用于下一步骤。

[1661] 产率: 570 mg (理论值的99%)。

[1662] $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 12.00 (bs, 1H, COOH), 8.73 (s, 1H), 8.24 – 8.22 (dd, 1H), 7.23 – 7.68 (m, 3H), 7.44 (t, 1H), 7.37 – 7.35 (dd, 1H), 4.76 – 4.65 (m, 5H, 氧杂环丁烷基), 3.13 (s, 3H)。

[1663] 步骤4

[1664] 8-(2,3-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-[甲基(氧杂环丁烷-3-基)氨基]-喹啉-3-甲酰胺 (实施例 331)



[1666] 向烧瓶中加入在10mL二氯甲烷中的8-(2,3-二氯苯基)-4-[甲基(氧杂环丁烷-3-基)氨基]喹啉-3-甲酸 (步骤3) (260 mg, 0.645 mmol)、(4S)-苯并二氢吡喃-4-胺盐酸盐 (131.7mg, 0.71mmol)、*N,N*-二异丙基乙胺 (250mg, 1.93mmol)、4-(*N,N*-二甲基氨基)吡啶 (39.4 mg, 0.32 mmol)、1-羟基-1*H*-苯并三唑 (43.5 mg, 0.32 mmol) 和1-乙基-3-(3-二甲基氨基丙基)碳二亚胺盐酸盐 (123.6mg, 0.645mmol)。将反应混合物在环境温度下搅拌过夜,然后与水混合,分离二氯甲烷相,经由硫酸钠/硅胶筒干燥,并在减压下除去溶剂。通过反相色谱法(洗脱液水/乙腈梯度)纯化残余物,得到标题化合物。

[1667] 产率: 130 mg (0.24 mmol, 理论值的37%)。

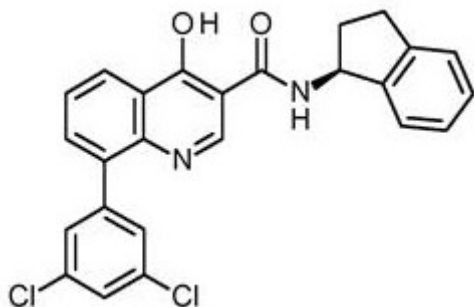
¹H-NMR 峰值列表 (399.9532 MHz, DMSO): δ = 9.1403 (1.94); 9.1288 (2); 9.1208 (2.32); 9.1103 (1.85); 8.6012 (10.54); 8.4715 (0.58); 8.3155 (1.57); 8.2143 (2.25); 8.1975 (2.56); 8.1729 (1.06); 7.7323 (2.07); 7.7127 (5.31); 7.6894 (10.46); 7.6737 (1.95); 7.4635 (1.67); 7.4521 (1.74); 7.4433 (2.94); 7.4332 (2.77); 7.4235 (2.08); 7.4143 (1.65); 7.3824 (1.86); 7.3618 (4.63); 7.3428 (4.44); 7.3225 (1.63); 7.1895 (1.81); 7.171 (3.64); 7.1535 (2.27); 6.9433 (2.6); 6.9255 (4.32); 6.9084 (2.02); 6.8059 (4.77); 6.7848 (4.45); 6.5782 (0.9); 5.2488 (1.97); 5.237 (2); 4.725 (1.91); 4.697 (7.04); 4.6722 (5.48); 4.6575 (5.6); 4.5955 (1.22); 4.5844 (1.61); 4.2921 (2.17); 4.2752 (3.94); 4.2675 (3.64); 4.2552 (2.23); 4.2471 (2.41); 4.2281 (0.89); 3.3183 (319.34); 3.2701 (0.87); 3.2496 (0.61); 3.1747 (0.71); 3.081 (16); 3.0759 (15.54); 2.9497 (1.08); 2.6703 (8.96); 2.5893 (0.63); 2.5051 (1239.6); 2.5012 (1583.24); 2.4971 (1204.24); 2.3276 (9.3); 2.2832 (0.88); 2.2475 (1.34); 2.2286 (1.72); 2.2205 (1.78); 2.1313 (0.96); 2.074 (5.92); 2.0168 (0.96); 1.2694 (0.87); 1.169 (4.47); 1.0034 (0.71); 0.9887 (0.75); 0.1463 (2.93); -0.0001 (642.47); -0.0792 (0.67); -0.1497 (3.13); -3.3083 (0.55).

[1669] 8-(3,5-二氯苯基)-N-[(1S)-2,3-二氢-1*H*-茛-1-基]-4-乙氧基喹啉-3-甲酰胺的合成(实施例 134)。

[1670] 步骤1

[1671] 8-(3,5-二氯苯基)-N-[(1S)-2,3-二氢-1*H*-茛-1-基]-4-羟基喹啉-3-甲酰胺

[1672]



[1673] 在环境温度下,将8-(3,5-二氯苯基)-4-羟基喹啉-3-甲酸 (5.50 g, 16.5 mmol) 在THF中的溶液用(1S)-茛满-1-胺(2.5ml, 20mmol)和三甲胺(9.2ml, 66mmol)搅拌处理10分钟。然后加入2,4,6-三丙基-1,3,5,2,4,6-三氧杂三磷杂环己烷2,4,6-三氧化物在乙酸乙酯(19.6ml, 50%含量, 33mmol)中的溶液,并在环境温度下搅拌过夜。加入水(100ml),并在减压下蒸发THF。加入更多的水和乙酸乙酯,并通过过滤澄清混合物。水相用乙酸乙酯萃取,并干燥合并的有机相和在减压下蒸发。通过柱色谱法在硅胶(340g)上用环己烷/乙酸乙酯(15-40%)纯化残余物。分离出两个级分:

[1674] 产率: 3.0 g (98%纯度,理论值的40%)和0.69 g (94%纯度,理论值的9%)。

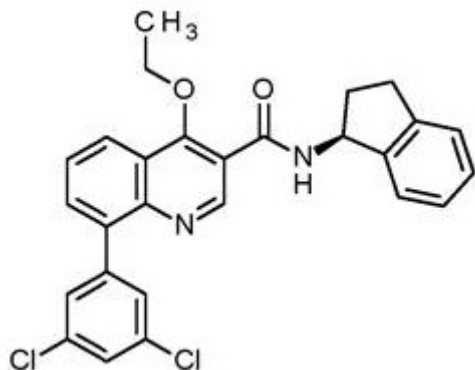
LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.27$ min; MS (ESI^{neg}): $m/z = 447$ [M+H]⁻

¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 1.849 (1.87), 1.868 (2.39), 1.880 (2.59), 1.900 (2.50), 1.921 (1.16), 2.578 (3.74), 2.588 (3.08), 2.841 (1.03), 2.862 (1.82), 2.882 (2.65), 2.902 (3.54), 2.922 (2.00), 2.977 (2.56), 2.990 (2.71), 2.999 (2.71), 3.029 (1.74), 5.474 (1.16), 5.493 (3.52), 5.512 (3.77), 5.531 (1.67), 7.197 (1.27), 7.214 (3.91), 7.233 (6.17), 7.256 (5.56), 7.280 (7.00), 7.298 (9.89), 7.316 (4.52), 7.521 (2.83), 7.540 (5.61), 7.560 (4.06), 7.626 (14.53), 7.631 (16.00), 7.695 (5.87), 7.713 (5.06), 7.804 (5.42), 8.297 (4.58), 8.318 (4.68), 8.611 (4.35), 8.624 (4.69), 10.285 (4.44), 10.304 (4.72), 11.637 (3.53).

[1675] 步骤2

[1677] 8-(3,5-二氯苯基)-N-[(1S)-2,3-二氢-1H-茛-1-基]-4-乙氧基喹啉-3-甲酰胺 (实施例 134)

[1678]



[1679] 在环境温度下,将 8-(3,5-二氯苯基)-N-[(1S)-2,3-二氢-1H-茛-1-基]-4-羟基喹啉-3-甲酰胺 (步骤1) (70.0 mg, 156 μ mol)、乙醇 (27 μ l, 470 μ mol)、三苯基膦 (61.3mg, 234 μ mol) 和 (E)-二氮烯-1,2-二甲酸二异丙基酯(46 μ l, 230 μ mol) 在THF(1ml)中搅拌6小时。加入5M甲酸(93 μ l, 470 μ mol),蒸发溶剂并通过制备用HPLC(C18,梯度:0.1%甲

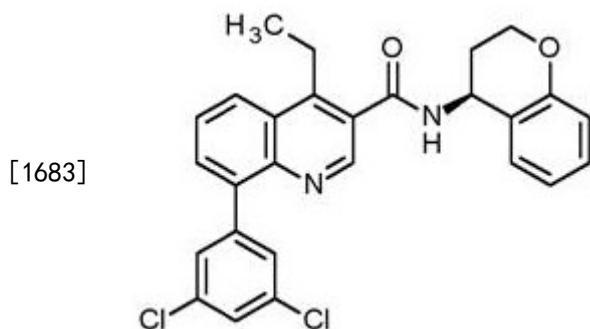
酸水溶液/乙腈)纯化残余物。

[1680] 产率: 40 mg (92 % 纯度,理论值的49 %)。

LC-MS (方法 L7): $R_t = 2.60$ min; MS (ESIpos): $m/z = 477$ [M+H]⁺

¹H-NMR(峰值列表) (500 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.007 (4.15), 0.007 (3.67), 1.235 (1.26), 1.395 (7.56), 1.409 (16.00), 1.423 (7.72), 1.950 (1.18), 1.966 (1.28), 1.975 (1.34), 1.991 (1.30), 2.522 (1.98), 2.853 (1.24), 2.869 (1.51), 2.885 (1.92), 2.901 (0.85), 2.981 (1.03), 2.989 (1.09), 2.999 (1.11), 3.006 (1.07), 3.013 (0.81), 3.286 (5.84), 4.352 (1.51), 4.354 (1.53), 4.366 (4.56), 4.368 (4.83), 4.380 (4.46), 4.383 (4.79), 4.394 (1.38), 4.396 (1.51), 5.533 (0.78), 5.549 (2.29), 5.564 (2.27), 5.580 (0.78), 5.754 (0.91), 7.227 (2.02), 7.231 (3.49), 7.238 (4.46), 7.245 (4.52), 7.249 (3.34), 7.260 (1.11), 7.278 (2.99), 7.290 (1.65), 7.294 (1.20), 7.400 (2.19), 7.406 (2.33), 7.417 (2.00), 7.654 (2.35), 7.658 (5.35), 7.661 (4.98), 7.674 (15.77), 7.678 (10.55), 7.714 (2.52), 7.729 (3.39), 7.731 (3.32), 7.745 (2.97), 7.889 (3.47), 7.891 (3.80), 7.903 (3.01), 7.906 (3.03), 8.304 (3.32), 8.307 (3.57), 8.321 (3.16), 8.324 (3.16), 8.842 (11.93), 8.998 (2.83), 9.015 (2.77).

[1682] 8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-乙基喹啉-3-甲酰胺的合成(实施例 350)。



[1684] 将二乙基锌在庚烷中的溶液(400 μ l, 1.0M, 400 μ mol)滴加到4-氯-8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺(步骤4, 实施例 4)(97 mg, 200 μ mol)和1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁-二氯化钡(II)二氯甲烷络合物(32.7 mg, 40.0 μ mol)在二噁烷(2 ml)中的混合物中,并在氩气氛下在90 $^{\circ}$ C下搅拌过夜。加入5M甲酸(160 μ l, 5.0M, 800 μ mol)和DMSO(1ml),并通过制备用HPLC(C18, 梯度:0.1%甲酸水溶液/乙腈)将过滤过的混合物纯化两次。

[1685] 产率: 52 mg (98 % 纯度,理论值的53 %)。

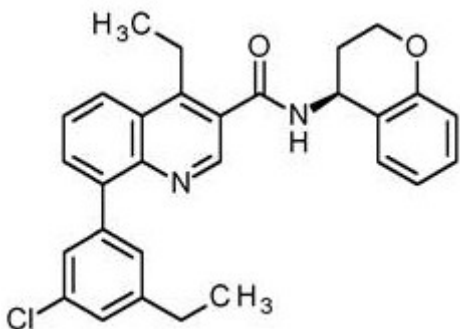
LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.35$ min; MS (ESIpos): $m/z = 477$ [M+H]⁺

¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 1.303 (2.43), 1.322 (5.61), 1.341 (2.50), 3.252 (2.09), 3.271 (2.06), 4.250 (1.06), 4.259 (1.62), 4.268 (1.95), 4.275 (1.54), 4.284 (1.06), 5.305 (0.92), 5.325 (0.92), 6.783 (1.53), 6.785 (1.66), 6.803 (1.75), 6.806 (1.83), 6.911 (0.78), 6.914 (0.83), 6.930 (1.72), 6.932 (1.71), 6.948 (1.03), 6.951 (1.00), 7.149 (0.86), 7.153 (0.89), 7.170 (1.43), 7.350 (1.48), 7.370 (1.41), 7.652 (16.00), 7.752 (1.09), 7.770 (1.68), 7.791 (1.47), 7.871 (1.93), 7.874 (2.04), 7.889 (1.44), 7.892 (1.42), 8.319 (1.50), 8.322 (1.58), 8.340 (1.43), 8.343 (1.39), 8.839 (5.77), 9.102 (1.60), 9.123 (1.55).

[1687] 8-(3-氯-5-乙基苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-乙基喹啉-3-甲酰

胺的分离 (实施例 351)。

[1688]



[1689] 实施例350中描述的制备用HPLC分离得到作为副产物的标题化合物。

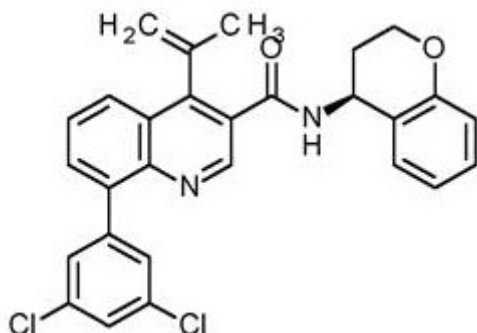
[1690] 产率: 12 mg (100% 纯度,理论值的13%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.36$ min; MS (ESIpos): $m/z = 471$ [M+H]⁺

[1691] ¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆): δ [ppm]= 9.10 (d, 1H), 8.81 (s, 1H), 8.29 (dd, 1H), 7.72 - 7.83 (m, 2H), 7.46 (t, 1H), 7.31 - 7.40 (m, 3H), 7.17 (t, 1H), 6.93 (td, 1H), 6.79 (dd, 1H), 5.27 - 5.35 (m, 1H), 4.22 - 4.31 (m, 2H), 3.21 - 3.29 (m, 2H) 被水信号叠加, 2.64 - 2.73 (m, 2H), 2.16 - 2.26 (m, 1H), 2.01 - 2.11 (m, 1H), 1.32 (t, 3H), 1.23 (t, 3H).

[1692] 8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(丙-1-烯-2-基)喹啉-3-甲酰胺的合成(实施例 317)

[1693]



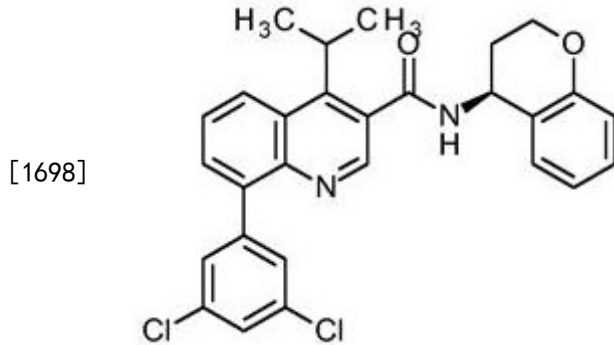
[1694] 在氩气气氛和连续超声处理下,在厚壁容器中,将碳酸钾(571mg,4.13mmol)溶解在5:1脱气的二噁烷和水的混合物(7.0ml)中。加入1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁-二氯化钨(II)二氯甲烷络合物(84.4 mg,103 μ mol)和4-氯-8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺(步骤4、实施例 4)(1.00 g,2.07 mmol),然后加入4,4,5,5-四甲基-2-(丙-1-烯-2-基)-1,3,2-二氧杂硼杂环戊烷(0.49ml,4.1mmol)。盖上容器并在80℃下搅拌4小时。加入5M甲酸(1.3ml)和水,并将混合物用乙酸乙酯萃取。将有机相干燥并在减压下蒸发。通过柱色谱法在硅胶(50g)上纯化残余物,洗脱液:环己烷/乙酸乙酯(7-16%)。

[1695] 产率: 885 mg (理论值的87%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.39$ min; MS (ESIpos): $m/z = 489$ [M+H]⁺

[1696] ¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆): 位移 [ppm] = 8.88 - 9.00 (m, 2H), 8.04 (dd, 1H), 7.90 (dd, 1H), 7.76 (dd, 1H), 7.67 (s, 3H), 7.32 (br d, 1H), 7.11 - 7.22 (m, 1H), 6.92 (t, 1H), 6.78 (dd, 1H), 5.54 (s, 1H), 5.18 - 5.30 (m, 1H), 5.03 (br s, 1H), 4.16 - 4.33 (m, 2H), 2.12 - 2.26 (m, 4H), 1.95 - 2.06 (m, 1H).

[1697] 8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-异丙基-喹啉-3-甲酰胺的合成 (实施例 359)



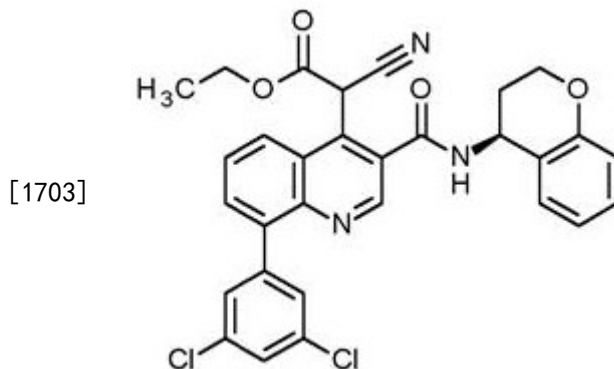
[1699] 在氩气气氛下,将8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(丙-1-烯-2-基)喹啉-3-甲酰胺 (得自实施例 317) (150 mg, 306 μ mol) 溶于乙酸乙酯 (7ml) 和乙醇 (3.5ml) 中。加入炭载Pd (44mg, 10%), 并将混合物在常压下和在环境温度下氢化1.5小时。通过硅藻土滤出催化剂,用乙酸乙酯/乙醇混合物 (2:1) 洗涤,并在减压下蒸发滤液。通过制备用HPLC (C18, 梯度: 0.1% 甲酸水溶液/乙腈) 将残余物纯化两次。

[1700] 产率: 64 mg (理论值的42%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.41$ min; MS (ESIpos): $m/z = 491$ [M+H]⁺

[1701] ¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆): 位移 [ppm] = 9.12 (d, 1H), 8.76 (s, 1H), 8.45 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.74 (t, 1H), 7.61 - 7.66 (m, 3H), 7.36 (d, 1H), 7.17 (t, 1H), 6.93 (t, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.25 - 5.31 (m, 1H), 4.21 - 4.31 (m, 2H), 3.82 - 3.92 (m, 1H), 2.21 (td, 1H), 2.06 (ddd, 1H), 1.56 (br d, 3H), 1.53 (br d, 3H).

[1702] 氰基{8-(3,5-二氯苯基)-3-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基氨基甲酰基]喹啉-4-基}乙酸乙酯的合成 (实施例 354)



[1704] 在氩气气氛下,在0℃下,将氢化钠 (165mg, 60% 含量, 4.13mmol) 加入到氰基乙酸

乙酯(0.44ml, 4.1mmol)在干燥的*N*-甲基吡咯烷酮中的溶液中,在环境温度下搅拌15分钟,直到气体逸出停止。然后,加入4-氯-8-(3,5-二氯苯基)-*N*-[(4*S*)-3,4-二氢-2*H*-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺(1.00 g, 2.07 mmol),并将混合物在70℃下搅拌3小时。冷却至环境温度后,加入5*M*甲酸(1.2ml, 6.2mmol)和水,并将混合物用乙酸乙酯萃取两次。将合并的有机相干燥并在减压下蒸发。残余物通过柱色谱法在硅胶(100g)上用环己烷/乙酸乙酯(5-50%)纯化。

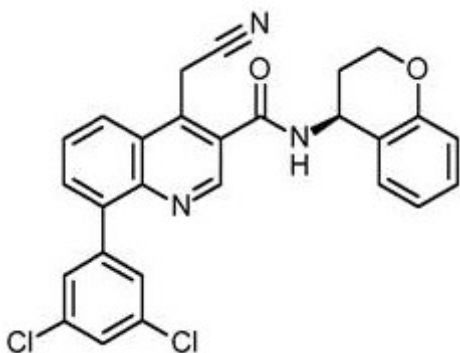
[1705] 产率: 650 mg (96 % 纯度,理论值的54 %)。

LC-MS (方法 L6): $R_t = 2.46$ min; MS (ESIpos): $m/z = 560$ [M+H]⁺

¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ [ppm]: -0.008 (3.55), 0.008 (3.23), 0.146 (0.40), 0.890 (0.44), 1.157 (2.49), 1.175 (7.53), 1.188 (4.41), 1.193 (9.23), 1.205 (8.20), 1.211 (4.25), 1.215 (2.56), 1.223 (4.21), 1.233 (2.01), 1.245 (1.50), 1.250 (2.12), 1.264 (0.77), 1.268 (1.05), 1.988 (9.00), 2.083 (0.45), 2.092 (0.48), 2.104 (0.46), 2.116 (0.65), 2.129 (0.70), 2.163 (1.14), 2.176 (1.60), 2.187 (1.26), 2.327 (0.47), 2.366 (0.41), 2.523 (1.67), 2.669 (0.54), 2.710 (0.46), 3.998 (2.03), 4.002 (0.89), 4.021 (2.14), 4.038 (2.14), 4.056 (0.79), 4.133 (0.51), 4.151 (0.98), 4.168 (0.93), 4.175 (0.83), 4.186 (0.84), 4.193 (1.11), 4.202 (2.21), 4.210 (1.51), 4.219 (4.66), 4.228 (3.20), 4.236 (4.66), 4.246 (3.73), 4.254 (2.15), 4.263 (1.53), 4.272 (0.85), 4.287 (1.21), 4.298 (1.72), 4.309 (1.16), 5.226 (0.78), 5.245 (0.83), 5.266 (0.79), 5.285 (0.73), 6.794 (1.56), 6.804 (5.05), 6.815 (1.91), 6.826 (4.30), 6.837 (0.92), 6.856 (1.42), 6.866 (0.52), 6.875 (0.87), 6.917 (0.71), 6.936 (1.45), 6.955 (0.86), 7.142 (0.96), 7.145 (0.95), 7.163 (1.28), 7.173 (0.83), 7.177 (0.93), 7.194 (1.20), 7.212 (0.58), 7.387 (1.34), 7.408 (1.79), 7.429 (1.14), 7.599 (0.99), 7.603 (1.04), 7.683 (16.00), 7.702 (0.43), 7.875 (1.05), 7.879 (1.00), 7.897 (2.37), 7.914 (1.62), 7.918 (1.55), 8.002 (3.30), 8.019 (2.41), 8.408 (1.18), 8.423 (1.48), 8.443 (1.15), 9.112 (4.72), 9.124 (4.29), 9.517 (1.49), 9.525 (1.44), 9.537 (1.51), 9.544 (1.34).

[1707] 4-(氰基甲基)-8-(3,5-二氯苯基)-*N*-[(4*S*)-3,4-二氢-2*H*-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺的合成(实施例 355)

[1708]



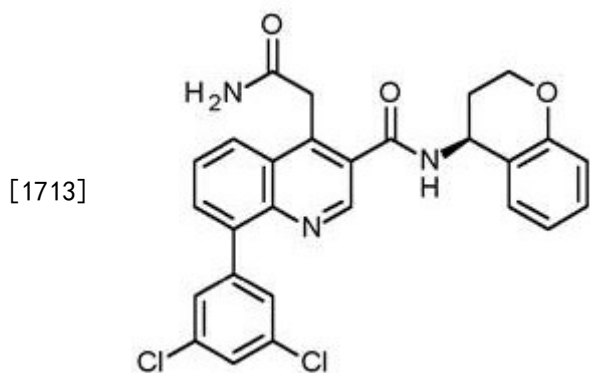
[1709] 用氯化钠(63mg, 1.1mmol)和水(0.24ml)处理氰基{8-(3,5-二氯苯基)-3-[(4*S*)-3,4-二氢-2*H*-色烯-4-基]氨基甲酰基}喹啉-4-基}乙酸乙酯(实施例 354)(300 mg, 0.54 mmol)在DMSO(2.4ml)中的溶液,并在90℃下在搅拌下加热过夜。加入水(2.5ml),滤出沉淀,用水洗涤并在真空中干燥。

[1710] 产率: 250 mg (99 % 纯度,理论值的95 %)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.24$ min; MS (ESIpos): $m/z = 488$ [M+H]⁺

[1711] ¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 2.099 (0.43), 2.136 (0.80), 2.145 (0.69), 2.205 (0.64), 2.224 (0.67), 2.239 (0.54), 4.266 (1.68), 4.277 (2.29), 4.711 (6.99), 5.278 (0.45), 5.294 (1.03), 5.312 (1.04), 5.326 (0.45), 6.798 (2.04), 6.818 (2.30), 6.899 (1.01), 6.917 (2.07), 6.936 (1.19), 7.163 (1.04), 7.182 (1.68), 7.200 (0.79), 7.387 (1.76), 7.405 (1.62), 7.677 (16.00), 7.883 (1.06), 7.903 (1.92), 7.922 (1.56), 7.988 (2.46), 8.006 (1.65), 8.417 (1.93), 8.437 (1.73), 9.029 (5.73), 9.379 (1.69), 9.399 (1.68).

[1712] 4-(2-氨基-2-氧代乙基)-8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺的合成 (实施例 360)



[1714] 将4-(氨基甲基)-8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺 (实施例 355) (150 mg, 307 μ mol) 在浓盐酸 (0.77 ml, 37%) 和二噁烷 (0.5 ml) 中的悬浮液在环境温度下搅拌3天。滤出固体,用二噁烷洗涤并在真空中干燥。

[1715] 产率: 90 mg (92 % 纯度,理论值的53 %)。

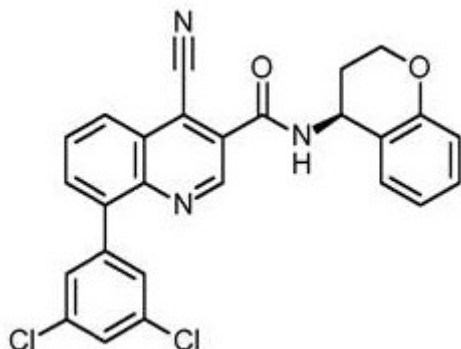
LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.13$ min; MS (ESIpos): $m/z = 506$ [M+H]⁺

[1716] ¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.149 (0.40), 0.008 (3.42), 2.068 (0.55), 2.085 (0.61), 2.095 (0.80), 2.208 (0.74), 2.220 (0.70), 2.229 (0.68), 2.242 (0.51), 2.327 (0.61), 2.366 (0.61), 2.670 (0.57), 2.710 (0.54), 2.794 (0.77), 3.568 (2.60), 4.179 (0.56), 4.197 (0.56), 4.216 (3.94), 4.225 (3.86), 4.238 (1.19), 4.264 (1.32), 4.283 (1.00), 5.270 (0.46), 5.285 (1.06), 5.304 (1.07), 5.319 (0.51), 6.779 (1.94), 6.800 (2.15), 6.883 (0.98), 6.899 (2.02), 6.918 (1.20), 7.147 (1.02), 7.164 (1.67), 7.185 (0.81), 7.349 (2.28), 7.369 (1.67), 7.659 (16.00), 7.764 (1.23), 7.782 (1.93), 7.803 (1.67), 7.894 (2.35), 7.910 (1.74), 7.989 (1.55), 8.349 (1.83), 8.368 (1.68), 8.949 (6.32), 9.468 (1.76), 9.488 (1.75).

[1717] 通过加入碳酸氢钠水溶液 (7ml, 1.5M) 将滤液调节至pH6并用乙酸乙酯萃取。将合并的有机相干燥,蒸发并通过制备用HPLC (C18, 梯度: 0.1% 甲酸水溶液/乙腈) 纯化残余物,得到第二产物 (40mg, 100% 纯度,理论值的26%)。

[1718] 4-氨基-8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺的合成 (实施例 362)

[1719]



[1720] 在氩气气氛下,在厚壁微波容器中加入4-氯-8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]喹啉-3-甲酰胺 (1.00 g, 2.07 mmol)、氯化铜(I) (185 mg, 2.07 mmol)、碳酸钠 (219 mg, 2.07 mmol)、1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁-二氯化钡(II)二氯甲烷络合物 (169 mg, 0.21 mmol) 和N-甲基吡咯烷酮 (7.2 ml), 加盖并在120°C搅拌下加热过夜。将反应混合物加入到氯化铵饱和水溶液/浓氨水的3:1混合物(120ml)和乙酸乙酯中, 搅拌30分钟并通过硅藻土过滤。分离各相, 有机相用氯化铵饱和水溶液/浓氨水的3:1混合物洗涤三次, 然后盐水洗涤并干燥。将残余物(1.06g)通过柱色谱法在硅胶(100g)上用环己烷/乙酸乙酯(3-30%)纯化。

[1721] 产率: 760 mg (93 % 纯度, 理论值的72%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.44$ min; MS (ESIpos): $m/z = 474$ [M+H]⁺

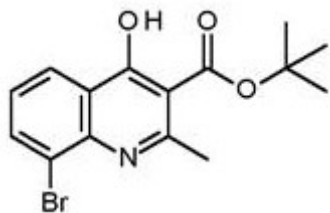
[1722] ¹H-NMR 峰值列表 (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.008 (0.70), 0.008 (0.49), 1.398 (16.00), 1.988 (0.45), 2.519 (0.43), 6.790 (0.48), 6.849 (0.44), 6.851 (0.45), 6.870 (0.51), 6.872 (0.48), 6.966 (0.40), 7.673 (0.41), 7.696 (4.12), 7.933 (0.43), 7.951 (0.60), 7.953 (0.54), 7.972 (0.53), 8.054 (0.67), 8.057 (0.62), 8.071 (0.49), 8.075 (0.41), 9.279 (0.96), 9.311 (0.50).

[1723] 8-(2,3-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(二甲基氨基)-2-甲基喹啉-3-甲酰胺的合成 (实施例 481)。

[1724] 步骤1

[1725] 8-溴-4-羟基-2-甲基喹啉-3-甲酸叔丁基酯

[1726]



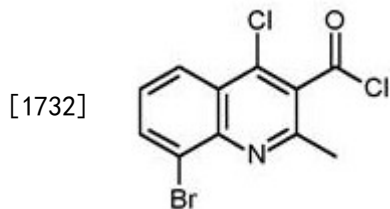
[1727] 向三颈烧瓶中加入氢化钠(910mg, 22.7mmol, 在矿物油中的60%分散体)和干燥的DMF(50mL)。将3-溴靛红酸酐(5 g, 20.6 mmol)缓慢加入(0.42g, 4mmol), 然后在室温下滴加溶解在50mL DMF中的3-氧代丁酸叔丁基酯(3.6g, 22.7mmol)。将反应混合物加热至120°C保持10分钟。然后在减压下除去溶剂, 并将剩余材料分散在水中, 用二氯甲烷萃取两次。将合并的有机层用硫酸钠干燥、过滤并在真空中浓缩。通过硅胶快速色谱法(洗脱液环己烷/乙酸乙酯梯度)纯化得到的残余物。

[1728] 产率: 1.05 g (2.96 mmol, 理论值的15%)。

[1729] $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 10.48 (s, 1H), 8.10 – 8.08 (d, 1H), 8.02 – 7.99 (d, 1H), 7.31 – 7.27 (t, 1H), DMSO 信号下的甲基单峰, 1.51 (s, 9H).

[1730] 步骤2

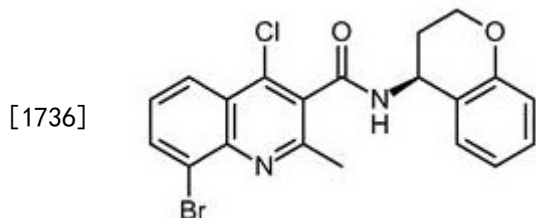
[1731] 8-溴-4-氯-2-甲基喹啉-3-甲酰氯



[1733] 向三颈烧瓶中加入8-溴-4-羟基-2-甲基喹啉-3-甲酸叔丁酯(1.2g, 3.54mmol)和磷酰氯(42g, 274mmol)并加热至回流16小时。将反应混合物在真空中浓缩,并原样用于下一步骤。

[1734] 步骤3

[1735] 8-溴-4-氯-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-2-甲基喹啉-3-甲酰胺



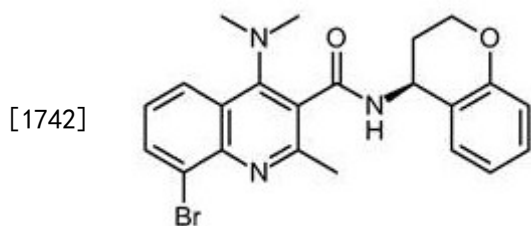
[1737] 将8-溴-4-氯-2-甲基喹啉-3-甲酰氯(步骤2的粗产物)(1g, 3.13mmol)溶解在60mL乙腈中并在0℃下与(4S)-苯并二氢吡喃-4-胺盐酸盐(582mg, 3.13mmol)和三乙胺(951mg, 9.4mmol)混合。使反应混合物温热至室温并搅拌直至完全转化。在减压下除去溶剂;将剩余的溶液用二氯甲烷萃取两次。将合并的有机层经硫酸钠干燥、过滤并在真空中浓缩。通过硅胶快速色谱法(洗脱液环己烷/乙酸乙酯梯度)纯化得到的残余物。

[1738] 产率: 766 mg (1.77 mmol, 理论值的55%)。

[1739] $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.29 (d, 1H, NH), 8.26 – 8.22 (t, 2H), 7.66 – 7.62 (dd, 1H), 7.38 – 7.36 (d, 1H), 7.20 – 7.16 (t, 1H), 6.97 – 6.93 (t, 1H), 6.82 – 6.80 (d, 1H), 5.32 – 5.28 (m, 1H), 4.34 – 4.29 (m, 1H), 4.23 – 4.17 (m, 1H), 2.71 (s, 3H), 2.28 – 2.22 (m, 1H), 2.10 – 2.03 (m, 1H).

[1740] 步骤4

[1741] 8-溴-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(二甲基氨基)-2-甲基喹啉-3-甲酰胺



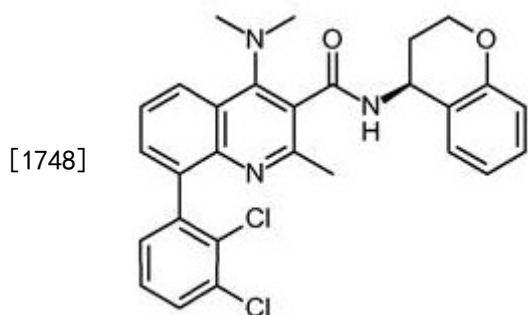
[1743] 将30 mL 二噁烷中的8-溴-4-氯-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-2-甲基喹啉-3-甲酰胺 (步骤3) (766 mg, 1.77 mmol) 分配到三个微波瓶(20mL体积)中。向其中各加入3.7mL二甲胺水溶液(40%, 合并的8.87mmol)。将反应混合物在微波炉(Anton Paars Monowave 400)中加热至100℃保持40分钟。合并反应混合物,并在减压下除去溶剂。通过硅胶快速色谱法(洗脱液环己烷/乙酸乙酯梯度)纯化得到的残余物。

[1744] 产率: 625 mg (1.42 mmol, 理论值的73%)。

[1745] $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.07 (d, 1H, NH), 8.08 – 8.02 (2d, 2H), 7.41 – 7.37 (t, 1H), 7.32 – 7.31 (d, 1H), 7.20 – 7.16 (t, 1H), 6.96 – 6.92 (t, 1H), 6.82 – 6.79 (d, 1H), 5.28 – 5.26 (m, 1H), 4.35 – 4.27 (m, 1H), 4.23 – 4.16 (m, 1H), 3.01 (s, 6H), 2.61 (s, 3H), 2.28 – 2.19 (m, 1H), 2.10 – 2.02 (m, 1H).

[1746] 步骤5

[1747] 8-(2,3-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(二甲基氨基)-2-甲基喹啉-3-甲酰胺 (实施例 481)



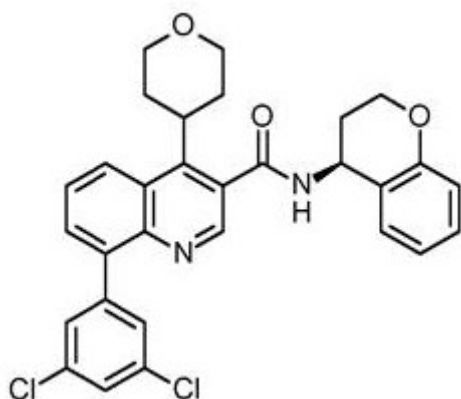
[1749] 向脱气(1分钟,氩气)的8-溴-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(二甲基氨基)-2-甲基喹啉-3-甲酰胺 (步骤4) (200 mg, 0.45 mmol)、(2,3-二氯苯基)硼酸(130mg, 0.68mmol)、碳酸钾 (125.5 mg, 0.90 mmol)、水(3.5mL)和二噁烷(12mL)的混合物加入1, 1'-双(二苯基膦基)二茂铁二氯化钡(II) (18.5mg, 0.02mmol)。将反应混合物在85℃下搅拌16小时,然后冷却至室温,用水稀释并用二氯甲烷萃取两次。将合并的有机层用硫酸钠干燥,过滤并在真空中浓缩。通过硅胶快速色谱法(洗脱液:环己烷/乙酸乙酯梯度)纯化所得残余物,得到标题化合物。

[1750] 产率: 159 mg (0.31 mmol, 理论值的66%)。

[1751] $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.06 (d, 1H, NH), 8.17 – 8.15 (d, 1H), 7.68 – 7.66 (d, 1H), 7.58 – 7.55 (m, 2H), 7.42 – 7.42 (m, 1H), 7.32 – 7.30 (m, 2H), 7.17 – 7.15 (t, 1H), 6.93 – 6.91 (t, 1H), 6.80 – 6.78 (d, 1H), 5.28 – 5.24 (m, 1H), 4.32 – 4.27 (m, 1H), 4.23 – 4.17 (m, 1H), 3.04 (s, 6H), DMSO 信号下的甲基单峰, 2.24 – 2.18 (m, 1H), 2.08 – 2.02 (m, 1H).

[1752] 8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(四氢-2H-吡喃-4-基)喹啉-3-甲酰胺的合成 (实施例 539)。

[1753]



[1754] 在氩气气氛下、将8-(3,5-二氯苯基)-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(3,6-二氢-2H-吡喃-4-基)喹啉-3-甲酰胺 (60.0 mg, 113 μmol) 溶于乙酸乙酯/乙醇(2:1, 6 ml)中。加入催化剂, 10%炭载钯(20 mg), 用氢气替代氩气, 并将混合物在氢气气氛压力下搅拌4.5小时。在氩气下加入更多10%炭载钯(20 mg)并在大气压下继续氢化6小时。用硅藻土过滤反应混合物, 用乙酸乙酯冲洗并在真空中浓缩。通过制备用HPLC(C18, 梯度: 0.1%甲酸水溶液/乙腈)纯化残余物(66mg)。

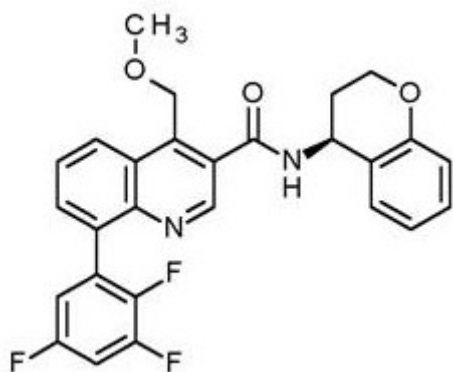
[1755] 产率: 11 mg (理论值的18%)。

LC-MS (方法 L1): Rt = 1.28 min; MS (ESIpos): m/z = 533 [M+H]⁺

¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 0.008 (2.51), 1.235 (0.43), 1.676 (1.54), 1.713 (2.60), 1.751 (1.67), 2.057 (0.97), 2.072 (1.11), 2.085 (1.87), 2.218 (1.33), 2.231 (1.31), 2.240 (1.26), 2.252 (0.92), 2.327 (0.56), 2.366 (0.60), 2.429 (2.14), 2.460 (2.25), 2.670 (0.69), 2.710 (0.67), 3.464 (1.07), 3.493 (1.97), 3.520 (2.14), 3.546 (2.15), 3.575 (1.18), 3.738 (1.26), 4.010 (3.17), 4.023 (2.81), 4.038 (2.85), 4.219 (0.82), 4.240 (2.21), 4.247 (1.78), 4.260 (2.15), 4.268 (2.70), 4.279 (2.21), 4.295 (1.97), 5.293 (0.94), 5.307 (2.08), 5.327 (2.08), 5.342 (0.90), 5.754 (5.00), 6.785 (3.97), 6.804 (4.38), 6.918 (1.97), 6.937 (4.07), 6.956 (2.40), 7.158 (2.10), 7.176 (3.37), 7.193 (1.61), 7.405 (3.52), 7.423 (3.20), 7.613 (13.15), 7.617 (16.00), 7.648 (4.20), 7.653 (5.68), 7.748 (2.29), 7.766 (3.65), 7.787 (3.20), 7.856 (4.95), 7.874 (3.52), 8.510 (3.43), 8.531 (3.17), 8.777 (12.63), 9.140 (3.54), 9.161 (3.54).

[1757] N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(甲氧基甲基)-8-(2,3,5-三氟苯基)喹啉-3-甲酰胺的合成 (实施例 686)。

[1758]



[1759] 步骤1

[1760] 8-溴-4-甲基喹啉-3-甲酸乙酯



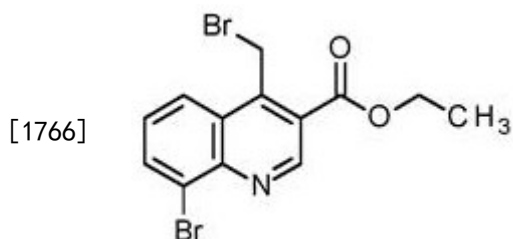
[1762] 在氩气下,向8-溴-4-羟基-喹啉-3-甲酸乙酯 (3.00 g, 9.54 mmol) (Gharat, al., W02013 / 118071) 在THF (45ml) 中的溶液中加入乙酰丙酮钴 (II) (2.45g, 9.54mmol)。将混合物在60℃的油浴中温热,滴加二甲基锌(甲苯中的溶液, 1.9ml, 2.0M, 3.8mmol) 并在该温度下搅拌1小时。在4.5小时期间,在该温度下分几份加入更多二甲基锌(在甲苯中的溶液, 6.2ml, 2.0M, 12.4mmol) 直至几乎所有起始材料被消耗 (HPLC监测)。将混合物倒入含有乙酸 (1.8ml) 的水 (250ml) 中,在减压下蒸发大部分有机溶剂,并用乙酸乙酯萃取水相。将合并的有机相干燥并蒸发至干。残余物 (3.1g) 通过柱色谱法在硅胶 (100g) 上纯化,洗脱液: 环己烷/乙酸乙酯 (3-10%), 得到标题化合物 (1.25g, 理论值的45%)。

LC-MS (方法 L4): $R_t = 3.06$ min; MS (ESIpos): $m/z = 294$ [M+H]⁺

[1763] ¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 1.369 (4.76), 1.387 (9.98), 1.405 (4.89), 2.934 (16.00), 4.393 (1.57), 4.411 (4.77), 4.429 (4.71), 4.447 (1.51), 7.615 (1.30), 7.634 (2.23), 7.655 (1.46), 8.253 (1.85), 8.271 (1.76), 8.340 (2.09), 8.361 (1.99), 9.185 (3.32).

[1764] 步骤2

[1765] 8-溴-4-(溴甲基)喹啉-3-甲酸乙酯



[1767] 将8-溴-4-甲基喹啉-3-甲酸乙酯 (1.50 g, 5.10 mmol) 溶解在THF (23ml) 中。加入三溴化苯基三甲基铵 (3.07 g, 8.16 mmol,) 和乙酸 (1.5 ml, 25 mmol), 在环境温度下搅拌混合物。

[1768] 加入更多的三溴化苯基三甲基铵 (0.96g, 2.5mmol) 并在环境温度下搅拌3天。加入另一部分三溴化苯基三甲基铵 (0.96g, 2.5mmol) 和乙酸 (0.9ml, 15.3mmol) 并继续搅拌过夜。用水和二氯甲烷稀释反应混合物。用二氯甲烷萃取水相,并将合并的有机层用碳酸氢钠水溶液洗涤,干燥并在30℃下在真空中浓缩。

[1769] 将残余物在MTBE (80ml) 中搅拌1小时。滤出固体,用MTBE洗涤并在真空中干燥。通过柱色谱法纯化粗产物 (3.23g), 洗脱液: 环己烷/乙酸乙酯 (3-22%)。

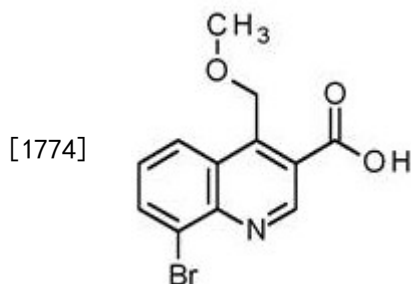
[1770] 产率: 985 mg (90.5 % 纯度, 理论值的47%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.11$ min; MS (ESIpos): $m/z = 371$ [M+H]⁺

[1771] ¹H-NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 1.401 (7.41), 1.415 (16.00), 1.429 (7.42), 1.435 (0.41), 4.441 (2.26), 4.455 (7.12), 4.470 (6.98), 4.484 (2.13), 5.479 (11.96), 5.758 (1.31), 7.721 (2.28), 7.736 (2.76), 7.738 (2.62), 7.753 (2.43), 8.311 (2.94), 8.314 (3.02), 8.326 (2.85), 8.329 (2.69), 8.446 (2.62), 8.448 (2.54), 8.463 (2.57), 8.465 (2.29), 9.311 (8.57).

[1772] 步骤3

[1773] 8-溴-4-(甲氧基甲基)喹啉-3-甲酸



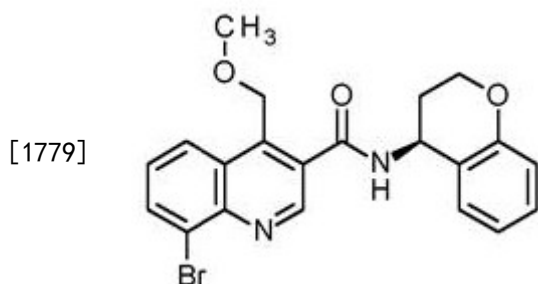
[1775] 在环境温度下,用甲醇钠(甲醇中的溶液,5.4M)逐滴处理8-溴-4-(溴甲基)喹啉-3-甲酸乙酯(1.14 g,3.06 mmol)在甲醇(15ml)中的悬浮液,在此期间发生溶解,随后沉淀出固体。1.5小时后,加入THF(5ml)和水(3ml),并在环境温度下继续搅拌过夜。然后将溶液用20mL水稀释,并通过加入乙酸(5M)将pH调节至4。在真空中浓缩除去大部分有机溶剂后,将剩余的混合物在乙酸乙酯和水之间分配。将水层用乙酸乙酯萃取几次,并将合并的有机层干燥并在真空中浓缩。该材料(363mg,91%纯度,理论值的37%)适合于进一步使用。将水相在减压下浓缩至小体积,用DMSO稀释并通过制备用HPLC(C18,梯度:0.1%甲酸水溶液/乙腈)纯化,得到第二产物(270mg,100%纯度,理论值的30%)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 0.69$ min; MS (ESIpos): $m/z = 296$ [M+H]⁺

[1776] ¹H-NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 1.221 (0.47), 3.184 (0.52), 5.199 (16.00), 7.611 (3.54), 7.627 (5.28), 7.643 (3.76), 8.238 (4.81), 8.252 (4.56), 8.351 (4.61), 8.367 (4.38), 9.215 (10.02).

[1777] 步骤4

[1778] 8-溴-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(甲氧基甲基)喹啉-3-甲酰胺



[1780] 用(4S)-苯并二氢吡喃-4-胺盐酸盐(1:1)和三甲胺(680 μ l,4.9mmol)处理8-溴-4-(甲氧基甲基)喹啉-3-甲酸(360 mg,1.22 mmol)在THF(6 ml)中的溶液。将混合物温热至45 $^{\circ}$ C,加入2,4,6-三丙基-1,3,5,2,4,6-三氧杂三磷杂环己烷2,4,6-三氧化物(在乙酸乙酯中的溶液,23ml,50%含量,39mmol),除去加热并将混合物在环境温度下搅拌过夜。在用

水 (pH8-9) 稀释后, 在真空中除去 THF。滤出沉淀并溶于约 10 ml 温热的丙酮。加入温水 (10mL) 并使混合物冷却至室温。滤出固体, 用丙酮/水 (1:2) 洗涤并在真空中干燥。

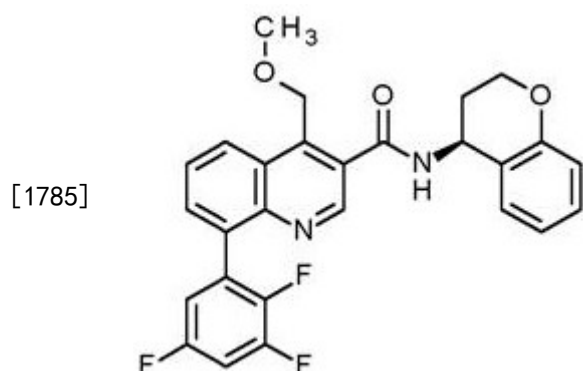
[1781] 产率: 391 mg (95 % 纯度, 理论值的 72 %)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 0.96$ min; MS (ESIpos): $m/z = 427$ [M+H]⁺

[1782] ¹H-NMR (600 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 1.235 (0.52), 2.090 (2.20), 2.230 (2.15), 3.287 (16.00), 4.241 (2.66), 4.293 (2.83), 4.998 (8.92), 5.314 (2.68), 6.800 (2.83), 6.811 (3.13), 6.943 (3.04), 7.183 (3.03), 7.397 (3.01), 7.612 (3.03), 8.211 (2.99), 8.221 (3.08), 8.311 (2.87), 8.324 (2.94), 8.998 (4.49), 9.207 (2.80).

[1783] 步骤 5

[1784] N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(甲氧基甲基)-8-(2,3,5-三氟苯基)喹啉-3-甲酰胺 (实施例 686)



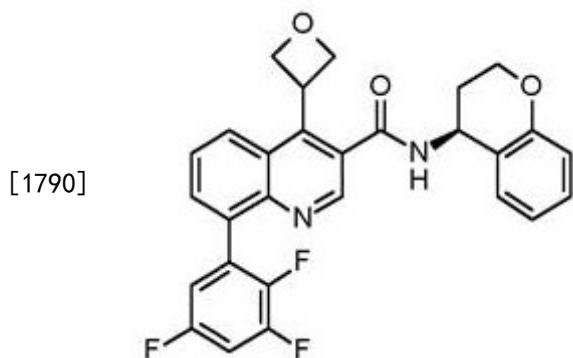
[1786] 在氩气下, 向容器中加入 8-溴-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(甲氧基甲基)喹啉-3-甲酰胺 (90 mg, 211 μ mol)、2,3,5-三氟苯硼酸 (55.6 mg, 316 μ mol)、1,1'-双(二苯基膦基)二茂铁-二氯化钡(II)二氯甲烷络合物 (8.60 mg, 10.5 μ mol)、碳酸钾 (58.2 mg, 421 μ mol), 并加入脱气的二噁烷和水 5:1 的混合物 (0.73 ml)。将混合物在 70°C 下搅拌过夜。将其用乙酸乙酯稀释, 通过硫酸钠塞过滤并在真空中浓缩。通过制备用 HPLC (C18, 梯度: 0.1% 甲酸水溶液/乙腈) 纯化粗产物。

[1787] 产率: 31 mg (理论值的 31 %)。

LC-MS (方法 L1): $R_t = 1.14$ min; MS (ESIpos): $m/z = 479$ [M+H]⁺

[1788] ¹H-NMR (600 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 0.005 (1.04), 2.043 (0.47), 2.048 (0.60), 2.053 (0.96), 2.058 (1.04), 2.065 (1.12), 2.069 (1.07), 2.077 (1.37), 2.081 (1.20), 2.087 (2.11), 2.092 (0.63), 2.193 (0.58), 2.199 (0.86), 2.202 (0.81), 2.207 (1.32), 2.213 (0.97), 2.216 (1.31), 2.221 (1.32), 2.230 (0.99), 2.236 (0.64), 2.239 (0.62), 2.244 (0.46), 2.793 (0.55), 3.345 (8.00), 4.220 (0.71), 4.225 (0.87), 4.234 (0.90), 4.239 (2.32), 4.244 (1.61), 4.253 (1.77), 4.258 (1.47), 4.268 (1.42), 4.273 (1.80), 4.279 (1.58), 4.285 (1.91), 4.292 (0.78), 4.298 (0.84), 4.303 (0.65), 5.037 (16.00), 5.287 (0.91), 5.297 (1.95), 5.310 (1.96), 5.320 (0.92), 6.790 (3.66), 6.791 (3.76), 6.803 (4.00), 6.804 (3.99), 6.917 (1.85), 6.918 (1.84), 6.929 (3.75), 6.931 (3.68), 6.942 (2.14), 6.943 (2.05), 7.159 (1.78), 7.161 (1.80), 7.173 (3.01), 7.184 (1.56), 7.187 (1.49), 7.259 (1.51), 7.267 (1.49), 7.274 (1.49), 7.376 (3.08), 7.388 (2.95), 7.609 (0.49), 7.614 (0.63), 7.619 (0.75), 7.624 (1.18), 7.628 (1.14), 7.633 (1.23), 7.638 (1.18), 7.642 (1.18), 7.646 (0.74), 7.651 (0.65), 7.657 (0.56), 7.800 (2.66), 7.812 (3.85), 7.814 (3.18), 7.826 (3.61), 7.873 (4.17), 7.875 (4.29), 7.885 (3.06), 7.887 (2.94), 8.416 (3.61), 8.418 (3.65), 8.430 (3.48), 8.432 (3.27), 8.890 (12.74), 9.184 (3.52), 9.197 (3.43).

[1789] N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-4-(氧杂环丁烷-3-基)-8-(2,3,5-三氟苯基)喹啉-3-甲酰胺的合成 (实施例 660)。

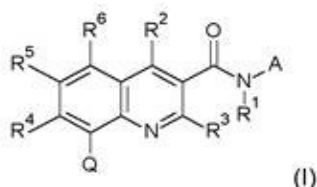


[1791] 在100 mL圆底烧瓶中,将4-氯-N-[(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基]-8-(2,3,5-三氟苯基)喹啉-3-甲酰胺 (500 mg, 1.066 mmol)、无水氢氧化锂 (51mg, 2.133mmol)、3-溴氧杂环丁烷 (0.133mL, 1.600mmol)、[4,4'-双(1,1-二甲基乙基)-2,2'-联吡啶-N1,N1']双[3,5-二氟-2-[5-(三氟甲基)-2-吡啶基-N]苯基-C]铱(III)六氟磷酸盐 (24mg, 0.021mmol) 和三(三甲基甲硅烷基)硅烷 (0.329mL, 1.066mmol) 在1,2-二甲氧基乙烷 (20mL) 中的混合物通过用氩气吹扫脱气。在50mL圆底烧瓶中,将氯化镍(II)乙二醇二甲醚络合物 (14mg, 0.064mmol) 和4,4'-二叔丁基-2,2'-联吡啶 (17mg, 0.064mmol) 在1,2-二甲氧基乙烷 (10mL) 中的混合物用热枪轻轻地加热,用氩气吹扫并搅拌五分钟。通过注射器将一半的该镍-催化剂混合物 (5mL) 加入到反应混合物中。将所得悬浮液用氩气吹扫五分钟,随后在用蓝色LED光照射下搅拌18小时,同时用风扇冷却。将反应混合物用二氯甲烷 (30mL) 稀释。加入水 (10mL) 并分离各层。用二氯甲烷 (2×10mL) 萃取水层。用硫酸钠干燥合并的有机层,并在真空中除去溶剂。通过快速柱色谱法 (80g; 庚烷, 10%-60% 乙酸乙酯) 和制备用HPLC (方法11) 纯化,得到0.054g (0.110mmol; 理论值的10%) 的标题化合物。

LC-MS (方法 2): $R_t = 3.65 \text{ min}$; $m/z = 491 (M+H)^+$

[1792] $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9.26 (d, $J = 8.1 \text{ Hz}$, 1H), 8.87 (s, 1H), 7.91 – 7.87 (m, 1H), 7.84 – 7.73 (m, 2H), 7.70 – 7.57 (m, 1H), 7.35 (d, $J = 7.8 \text{ Hz}$, 1H), 7.30 – 7.23 (m, 1H), 7.19 (t, $J = 7.8 \text{ Hz}$, 1H), 6.93 (t, $J = 7.5 \text{ Hz}$, 1H), 6.81 (d, $J = 8.2 \text{ Hz}$, 1H), 5.31 – 5.11 (m, 4H), 4.84 – 4.70 (m, 2H), 4.34 – 4.21 (m, 2H), 2.25 – 2.15 (m, 1H), 2.08 – 2.01 (m, 1H).

表 1: 实施例



[1793]

编号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Q	A
1	H	氯	H	H	H	H	3,5-二甲基苯基	(1S)-1,2,3,4-四氢 萘-1-基
2	H	氯	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-1,2,3,4-四氢 萘-1-基
3	H	氯	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H- 茚-1-基
4	H	氯	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
5	H	氯	H	H	H	H	3-氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
6	H	氯	H	H	H	H	3-氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H- 茚-1-基
7	H	氯	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
8	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
9	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H- 茚-1-基
10	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氯-6-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
11	H	二甲基氨基	H	H	甲基	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H- 茚-1-基
12	H	二甲基氨基	H	H	甲基	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
13	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯-4-氟苯 基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基

[1794]

14	H	吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
15	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
16	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-1,2,3,4-四氢萘-1-基
17	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
18	H	二甲基氨基	H	甲基	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
19	H	二甲基氨基	H	甲基	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
20	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-1,2,3,4-四氢萘-1-基
21	H	二甲基氨基	H	氟	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
22	H	二甲基氨基	H	氟	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
23	H	甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯-4-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
24	H	甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
25	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3-氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
26	H	1H-咪唑-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
27	H	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基氨基	H	H	H	H	3-氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
28	H	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
29	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
30	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,4-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1795]

31	H	二甲基氨基	H	H	H	H	4-氟-3-甲氧基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
32	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,4-二氟-3-甲氧基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
33	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氟-2-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
34	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
35	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3-氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
36	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氯-2-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
37	H	二甲基氨基	H	H	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
38	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,4,6-三氟-3-甲氧基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
39	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氯-5-(三氟甲基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
40	H	二甲基氨基	H	H	氟	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
41	H	二甲基氨基	H	H	氟	H	3,5-二氯-4-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
42	H	吗啉-4-基	H	H	氟	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
43	H	吗啉-4-基	H	H	氟	H	3,5-二氯-4-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
44	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氯-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
45	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氯-4-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
46	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
47	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,4,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1796]

48	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氟-3-(三氟甲氧基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
49	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
50	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氟-3-(三氟甲氧基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
51	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
52	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
53	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,4-二氟-3-甲氧基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
54	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯-4-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
55	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氟-4-甲氧基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
56	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氯-4-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
57	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,4,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
58	H	氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
59	H	苄基(甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
60	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氯-3-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
61	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氟-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
62	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氟吡啶-2-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
63	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氟吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
64	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-甲氧基吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1797]

65	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氯吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
66	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,6-二甲基吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
67	H	二乙基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
68	H	4-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
69	H	1H-吡啶-4-基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茛-1-基
70	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-(二甲基氨基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
71	H	二甲基氨基	H	H	H	H	1-甲基-1H-苯并咪唑-6-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
72	H	1H-吡啶-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
73	H	二甲基氨基	H	H	H	H	1H-咪唑-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
74	H	(2-羟基乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
75	H	(2-甲氧基乙基)(甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
76	H	(2-甲氧基乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
77	H	4-氧代咪唑烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
78	H	双(2-甲氧基乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
79	H	吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茛-1-基
80	H	(2S)-2-羧基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茛-1-基
81	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,3,4-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1798]

82	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,3,4-三氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
83	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2-氟-3-(三氟甲氧基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
84	H	(3R)-3-氨基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
85	H	3,4-二氢异喹啉-2(1H)-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
86	H	苯胺基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
87	H	异丁基(甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
88	H	[2-(二甲基氨基)乙基]氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
89	H	(2-甲氧基乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
90	H	乙基(2-甲氧基乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
91	H	(2S)-2-(甲氧基甲基)吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
92	H	(2R)-2-(甲氧基甲基)吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
93	H	双(2-甲氧基乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
94	H	(3S)-3-(二甲基氨基)吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
95	H	四氢-2H-吡喃-4-基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
96	H	[2-(吡咯烷-1-基)乙基]氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
97	H	(3,3,3-三氟丙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
98	H	吗啉-4-基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基

[1799]

99-1	H	(吡啶-2-基甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
99-2	H	[(2R)-1-羟基丁烷-2-基]氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
100	H	(2-羟基乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
101	H	(3R)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
102	H	3-羟基氮杂环丁烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
103	H	3-(吡咯烷-1-基)氮杂环丁烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
104	H	环丙基(乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
105	H	环丁基(甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
106	H	(环丙基甲基)(甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
107	H	2,2-二甲基咪啉-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
108	H	1,2-噁唑烷-2-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
109	H	(2S)-2-甲基-2,3-二氢-1H-咪啉-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
110	H	甲基(2,2,2-三氟乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
111	H	1,3-二氢-2H-异咪啉-2-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
112	H	3,3-二氟吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
113	H	(2S)-2-氨基甲酰基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
114	H	甲基(1-苯基乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基

[1800]

115	H	(3-氨基-3-氧代丙基)(甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
116	H	4-乙酰基哌嗪-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
117	H	1,1-二氧化硫代吗啉-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
118	H	苄基(甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
119	H	3-氟氮杂环丁烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
120	H	3-甲基氮杂环丁烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
121	H	3,3-二氟氮杂环丁烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
122	H	[3-(二甲基氨基)-3-氧代丙基]氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
123	H	[[5-甲基-1,2,4-噁二唑-3-基)甲基]氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
124	H	(3-氨基-3-氧代丙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
125	H	[2-(1H-吡唑-1-基)乙基]氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
126	H	(2-乙酰氨基乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
127	H	[(2S)-1-氨基-1-氧代丙烷-2-基]氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
128	H	(2-甲氧基-2-氧代乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
129	H	(2-氨基-2-氧代乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
130	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
131	H	甲氧基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1801]

132	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,3,5-三氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
133	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,3,5-三氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
134	H	甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
135	H	氮杂环丁烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
136	H	吡啶-4-基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
137	H	(2-乙氧基-2-氧代乙基)(甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
138	H	(2-羟基乙基)(甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
139	H	二甲基氨基	H	氟	H	H	3,4-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
140	H	二甲基氨基	H	氟	H	H	3,4-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
141	H	二甲基氨基	H	氟	H	H	3-氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
142	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
143	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	3-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
144	H	吗啉-4-基	H	H	氟	H	3,4-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
145	H	二甲基氨基	H	H	氟	H	3,4-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
146	H	二甲基氨基	H	H	氟	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
147	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-6-甲氧基-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1802]

148	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基	(1S)-5-甲氧基-2,3-二氢-1H-茚-1-基
149	H	甲基[2-(吗啉-4-基)乙基]氨基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
150	H	(羧基甲基)(甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
151	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-(二甲基氨基)-2,4-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
152	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-7-氟-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
153	H	乙基氨基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
154	H	2-乙酰肼基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
155	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	3-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
156	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	3,4-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
157	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	3,4-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
158	H	吗啉-4-基	H	H	氟	H	3,4-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
159	H	吗啉-4-基	H	H	氟	H	3-氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
160	H	吗啉-4-基	H	H	氟	H	3-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
161	H	吗啉-4-基	H	H	氟	H	2-氯-3-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
162	H	吗啉-4-基	H	H	氟	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
163	H	吗啉-4-基	H	H	氟	H	3-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
164	H	吗啉-4-基	H	H	氟	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1803]

165	H	吗啉-4-基	H	H	氟	H	2-氯-4-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
166	H	吗啉-4-基	H	H	氟	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
167	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	3-氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
168	H	二甲基氨基	H	氟	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
169	H	二甲基氨基	H	氟	H	H	3-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
170	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
171	H	二甲基氨基	H	氟	H	H	3-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
172	H	二甲基氨基	H	氟	H	H	2-氯-4-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
173	H	二甲基氨基	H	H	氟	H	3,4-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
174	H	二甲基氨基	H	H	氟	H	3-氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
175	H	二甲基氨基	H	H	氟	H	3-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
176	H	二甲基氨基	H	H	氟	H	2-氯-3-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
177	H	二甲基氨基	H	H	氟	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
178	H	二甲基氨基	H	H	氟	H	3-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
179	H	二甲基氨基	H	H	氟	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
180	H	二甲基氨基	H	H	氟	H	2-氯-4-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
181	H	硫代吗啉-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1804]

182	H	(2-叔丁氧基-2-氧代乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
183	H	(2-叔丁氧基-2-氧代乙基)(甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
184	H	丙基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
185	H	(2-氨基乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
186	H	(3R)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
187	H	(3S)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
188	H	1H-1,2,3-三唑-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
189	H	2H-1,2,3-三唑-2-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
190	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3-氯-4-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
191	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	5-氯-2,4-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
192	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
193	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯-4-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
194	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
195	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	5-氯-2,4-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
196	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3-氯-4-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
197	H	二甲基氨基	H	H	H	H	5-氯-2,4-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
198	甲基	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1805]

199	H	甲基(苯基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
200	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
201	H	3,3-二氟吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
202	H	3-氧代吡啶烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
203	H	1,1-二氧化硫代吗啉-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
204	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,3-二氢-1-苯并呋喃-7-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
205	H	吗啉-4-基	H	氯	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
206	H	吗啉-4-基	H	氯	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
207	H	二甲基氨基	H	氯	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
208	H	二甲基氨基	H	氯	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
209	H	吗啉-4-基	H	H	H	氟	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
210	H	吗啉-4-基	H	H	H	氟	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
211	H	吗啉-4-基	H	H	氯	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
212	H	吗啉-4-基	H	H	氯	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
213	H	二甲基氨基	H	H	氯	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
214	H	吗啉-4-基	H	H	H	甲基	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
215	H	吗啉-4-基	H	H	H	甲基	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1806]

216	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	5-(甲氧基羰基)-1,3-苯并噻唑-7-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
217	H	二甲基氨基	H	H	H	甲基	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
218	H	二甲基氨基	H	H	H	甲基	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
219	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,4-二氟-3-羟基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
220	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3-氟-2-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
221	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
222	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
223	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
224	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	1,3-苯并噻唑-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
225	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3-氟-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
226	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
227	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
228	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3-氯-5-甲氧基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
229	H	甲基氨基	H	H	H	H	3-氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
230	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,5-二氟-4-甲氧基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
231	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	5-氯-2-氟-4-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
232	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3,4-二氟-2-甲氧基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1807]

233	H	吗啉-4-基	H	三氟 甲基	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
234	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
235	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3-氯-5-(三氟甲 基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
236	H	甲基氨基	H	H	H	H	3-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
237	H	甲基氨基	H	H	H	H	2,3,5-三氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
238	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2-氯-3-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
239	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	5-氯-2-氟-3-甲基 苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
240	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3-氯-2-氟-5-甲基 苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
241	H	(2S)-2-(叔丁氧基 羰基)吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H- 茚-1-基
242	H	(2S)-2-(叔丁氧基 羰基)吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
243	H	(2R)-2-(叔丁氧基 羰基)吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
244	H	(3rac)-3-羟基吡咯 烷-1-基	H	H	H	H	3-氟-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
245	H	(3rac)-3-羟基吡咯 烷-1-基	H	H	H	H	3,4-二氟-2-甲氧 基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
246	H	(3rac)-3-羟基吡咯 烷-1-基	H	H	H	H	2,5-二氟-4-甲氧 基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
247	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,3,6-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
248	H	甲氧基(甲基)氨 基	H	H	H	H	2-氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
249	H	甲氧基(甲基)氨 基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基

[1808]

250	H	甲氧基(甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
251	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	1,3-苯并噻唑-7-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
252	H	环丙基(甲基)氨基	H	H	H	H	2-氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
253	H	环丙基(甲基)氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
254	H	环丙基(甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
255	H	(2S)-2-(甲氧基羰基)吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
256	H	二甲基氨基	H	三氟甲基	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
257	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
258	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	2-氯-3-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
259	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	2-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
260	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3-氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
261	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3-氯-5-甲氧基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
262	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
263	H	(2R)-2-(甲氧基羰基)吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
264	H	2,2-二甲基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
265	H	乙基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
266	H	(2S)-2-羧基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1809]

267	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	5-氯-2-甲氧基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
268	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	5-氟-2-甲氧基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
269	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	5-氯-2-甲氧基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
270	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	5-氟-2-甲氧基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
271	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3-氯-5-(三氟甲基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
272	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	5-氯-2-氟-3-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
273	H	环丙基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
274	H	(2R)-2-羧基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
275	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3-氯-2-氟-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
276	H	(甲酸根合甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
277	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,6-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
278	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	2,6-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
279	H	二甲基氨基	H	氟	H	H	2,6-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
280	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	1,3-苯并噁唑-7-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
281	H	(3S)-3-(甲氧基羰基)吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
282	H	(3R)-3-(甲氧基羰基)吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
283	H	(3R)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1810]

284	H	(3S)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
285	H	[(二乙氧基磷酰基)甲基](甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
286	H	[2-(环丙基氨基)乙基]氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
287	H	(2R)-2-(羟基甲基)吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
288	H	(2S)-2-(羟基甲基)吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
289	H	[(1R,3S)-3-氨基-2,2-二甲基环丙基]氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
290	H	(2S)-2-甲基吗啉-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
291	H	(3rac,4rac)-3-氨基-4-氟吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
292	H	(2rac)-2-羧基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
293	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,4-二氯-5-(二甲基氨基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
294	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氯-5-(二甲基氨基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
295	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	5-氯-2-氟-4-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
296	H	二甲基氨基	H	H	H	H	苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
297	H	(2-羟基乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
298	H	(2-甲氧基乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
299	H	(2R)-2-甲酸根合吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基

[1811]

300	H	6-氧杂-3-氮杂双 环[3.1.1]庚-3-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
301	H	3,9-二氧杂-7-氮杂 双环[3.3.1]壬-7-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
302	H	8-氧杂-3-氮杂双 环[3.2.1]辛-3-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
303	H	(2R,6S)-2,6-二甲 基吗啉-4-基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
304	H	(2R,6S)-2,6-二甲 基吗啉-4-基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
305	H	(2R,6S)-2,6-二甲 基吗啉-4-基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H- 茚-1-基
306	H	(2R,6S)-2,6-二甲 基吗啉-4-基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基	(1S)-2,3-二氢-1H- 茚-1-基
307	H	二甲基氨基	H	H	H	H	4-氯-3-(二甲基氨 基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
308	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯-4-(二甲 基氨基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
309	H	吗啉-4-基	H	甲基 氧基	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
310	H	吗啉-4-基	H	甲基 氧基	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
311	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氯-4-(二甲基氨 基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
312	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-(甲基氨基)苯 基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
313	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,6-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
314	H	吗啉-4-基	H	三氟 甲基	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
315	H	二甲基氨基	H	三氟 甲基	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基
316	H	二甲基氨基	H	H	氯	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H- 色烯-4-基

[1812]

317	H	(3rac)-3-羟基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
318	H	(3S)-3-(羟基甲基)吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
319	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2-氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
320	H	(2S)-2-(乙氧基羰基)吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
321	H	2,4-二甲基-3,5-二氧代-1,2,4-三唑烷-1-基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
322	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3-(三氟甲氧基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
323	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氯-5-(吗啉-4-基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
324	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氯-4-(二甲基氨基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
325	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氯-4-(二甲基氨基)-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
326	H	二甲基氨基	H	甲基 氧基	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
327	H	二甲基氨基	H	甲基 氧基	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
328	H	甲基[2-(2-氧代吡咯烷-1-基)乙基]氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
329	H	(3R)-3-(羟基甲基)吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
330	H	二甲基氨基	H	氟	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
331	H	甲基(氧杂环丁烷-3-基)氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
332	H	(3R)-3-羧基吡咯烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1813]

333	H	甲基氧基	H	H	H	H	3,5-二氯-4-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
334	H	乙基氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
335	H	异丙基氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
336	H	异丙基氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
337	H	环戊基氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
338	H	(2-甲氧基乙基)氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
339	H	四氢-2H-吡喃-4-基氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
340	H	(2-羟基乙基)氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
341	H	乙基氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
342	H	(3,3-二甲基丁基)氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
343	H	(3-氟苄基)氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
344	H	(2,3-二氟苄基)氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
345	H	(3-甲氧基苄基)氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
346	H	(3R)-吡咯烷-3-基氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
347	H	(3-甲氧基-3-甲基丁基)氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
348	H	(环戊基甲基)氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
349	H	异丙基氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基

[1814]

350	H	乙基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
351	H	乙基	H	H	H	H	3-氯-5-乙基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
352	H	甲基	H	H	H	H	3-氯-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
353	H	甲基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
354	H	1-氟基-2-乙氧基-2-氧代乙基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
355	H	氟基甲基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
356	H	丙基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
357	H	丙-1-烯-2-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
358	H	环丙基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
359	H	异丙基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
360	H	2-氨基-2-氧代乙基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
361	H	次氨基甲基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
362	H	(2-羟基乙基)硫烷基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
363	H	吡啶-2-基硫烷基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
364	H	(2-羟基乙基)硫烷基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
365	H	甲基硫烷基	H	H	H	H	3-氯-5-(甲基硫烷基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
366	H	乙基硫烷基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

367	H	乙基硫烷基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
368	H	乙基亚磺酰基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
369	H	乙基磺酰基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
370	H	乙基亚磺酰基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
371	H	乙基磺酰基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
372	H	(2-羧基乙基)硫烷基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
373	H	甲基氧基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1815]

编号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	Q	A
374	H	(2rac)-2-(三氟甲基)吗啉-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
375	H	(2-甲氧基-2-氧代乙基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
376	H	H	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
377	H	二甲基氨基	H	H	H	H	5-氟-2-甲氧基吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
378	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氟基吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
379	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氨基吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
380	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-甲基吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
381	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-甲基吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
382	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氯吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
383	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氟吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
384	H	甲基氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
385	H	甲基氨基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1816]

386	H	异丙基	H	H	H	H	2,3,5-三氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
387	H	二甲基氨基	H	H	H	H	5-氰基-4-甲基-2-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
388	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,5-二甲基-3-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
389	H	二甲基氨基	H	H	H	H	5-氰基-2-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
390	H	二甲基氨基	H	H	H	H	5-氯-2-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
391	H	二甲基氨基	H	H	H	H	5-甲基-2-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
392	H	3-氟氮杂环丁烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
393	H	4-氟吡啶-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
394	H	3,3-二氟氮杂环丁烷-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
395	H	甲基氨基	H	氟	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
396	H	吡啶-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
397	H	2-氧代-1,2-二氢吡啶-5-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
398	H	4,4-二氟吡啶-1-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
399	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-吗啉-4-基吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
400	H	二甲基氨基	H	H	H	H	5-氯-2-甲氧基吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
401	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-甲氧基吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
402	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-(羟基甲基)吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
403	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氟吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
404	H	环丁基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
405	H	2-羟基乙基氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
406	H	异丙基	H	H	H	H	3-氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
407	H	异丙基	H	H	H	H	3-(三氟甲氧基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
408	H	异丙基	H	H	H	H	2-氟-3-(三氟甲基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
409	H	异丙基	H	H	H	H	3-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
410	H	异丙基	H	H	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
411	H	异丙基	H	H	H	H	3-(三氟甲基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1817]

412	H	2-氨基嘧啶-5-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
413	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,6-二氟吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
414	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氯-3-氟吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
415	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,5-二氯吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
416	H	二甲基氨基	H	H	H	H	5-氟-2-异丙基氧基吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
417	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-乙氧基-5-氟吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
418	H	异丙基	H	H	H	H	2-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
419	H	异丙基	H	H	H	H	3-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
420	H	异丙基	H	H	H	H	2-氯-3-(三氟甲基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
421	H	异丙基	H	H	H	H	2-氯-3-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
422	H	异丙基	H	H	H	H	2,5-二甲基-3-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
423	H	异丙基	H	H	H	H	2,5-二氯-3-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
424	H	2-氨基乙基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
425	H	异丙基	H	氟	H	H	2,5-二甲基-3-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
426	H	异丙基	H	氟	H	H	2,5-二氯-3-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
427	H	甲氧基(甲基)氨基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
428	H	二甲基氨基	H	H	氰基	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
429	H	二甲基氨基	H	H	羟基	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
430	H	异丙基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
431	H	异丙基	H	H	H	H	3-氯-5-(三氟甲基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
432	H	(二甲基氨基)甲基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
433	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,5-双(三氟甲基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
434	H	二甲基氨基	H	H	H	H	5-氟-2-(三氟甲基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
435	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
436	H	二甲基氨基	H	H	H	H	5-氟-2-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
437	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氟-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1818]

438	H	异丙基	H	H	H	H	3,5-二氯-4-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
439	H	3-氟-2-氧代-1,2-二氢吡啶-5-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
440	H	氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
441	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,5-二氯-3-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
442	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3-氯-2-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
443	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	5-氯-2-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
444	H	异丙基	H	H	H	H	3-氯-2-氟-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
445	H	1,2-噁唑烷-2-基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
446	H	异丙基	H	H	H	H	3-氯-4-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
447	H	异丙基	H	H	H	H	2,5-二甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
448	H	异丙基	H	H	H	H	3-氟-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
449	H	异丙基	H	H	H	H	3,4,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
450	H	异丙基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
451	H	异丙基	H	H	H	H	2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
452	H	甲氧基(甲基)氨基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
453	H	异丙基	H	H	H	H	2,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
454	H	1H-吡啶-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
455	H	异丙基	H	氟	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
456	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-甲基-1,3-噻唑-5-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
457	H	二甲基氨基	H	H	H	H	4-氯-2-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
458	H	二甲基氨基	H	H	H	H	5-(三氟甲基)-2-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
459	H	二甲基氨基	H	H	H	H	5-氟-2-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
460	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
461	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,5-双(三氟甲基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
462	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
463	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	5-氟-2-(三氟甲基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1819]

464	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
465	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2-氯-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
466	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	5-氟-2-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
467	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2-氟-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
468	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,5-二甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
469	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
470	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氯-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
471	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,5-二甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
472	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,6-二甲氧基吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
473	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氯-6-甲基吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
474	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,3-二甲氧基吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
475	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氯-2-甲氧基吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
476	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,3-二氯吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
477	H	异丙基	H	氟	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
478	H	乙烯基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
479	H	异丙基	H	氟	H	H	3-(三氟甲氧基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
480	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,5-二甲基-3-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
481	H	吗啉-4-基	甲基	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
482	H	2,2-二氟乙基(甲基)氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
483	H	吗啉-4-基	甲基	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
484	H	氧杂环丁烷-3-基甲基氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
485	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	3,5-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
486	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	1,3-苯并噻唑-7-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
487	H	异丙基	H	氟	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
488	H	异丙基	H	氟	H	H	3-(三氟甲基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
489	H	3-噻吩基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1820]

490	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	2,5-二甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
491	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	2,3-二氯苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
492	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	2,3-二氯苯基	(1S)-1,2,3,4-四氢萘-1-基
493	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(3rac)-2,3-二氢-1-苯并噻吩-3-基
494	H	环戊基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
495	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,3-二氯-5-羟基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
496	H	吗啉-4-基	H	H	H	甲氧基	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
497	H	吗啉-4-基	H	H	H	甲氧基	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
498	H	吗啉-4-基	H	H	甲氧基	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
499	H	吗啉-4-基	H	H	甲氧基	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
500	H	吗啉-4-基	H	H	甲氧基	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
501	H	二甲基氨基	H	H	甲氧基	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
502	H	二甲基氨基	H	H	甲氧基	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
503	H	二甲基氨基	H	H	甲氧基	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
504	H	二甲基氨基	H	H	H	甲氧基	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
505	H	二甲基氨基	H	H	H	甲氧基	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
506	H	二甲基氨基	H	H	H	甲氧基	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
507	H	二甲基氨基	H	H	H	氯	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
508	H	二甲基氨基	H	H	H	氯	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
509	H	二甲基氨基	H	H	H	氯	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
510	H	二甲基氨基	H	H	三氟甲基	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
511	H	二甲基氨基	H	H	三氟甲基	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
512	H	吗啉-4-基	H	H	三氟甲基	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
513	H	吗啉-4-基	H	H	三氟-甲基	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
514	H	吗啉-4-基	H	H	三氟-甲基	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
515	H	甲基(氧杂环己烷-4-基甲基)氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1821]

516	H	甲氧基(甲基)氨基	H	氟	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
517	H	吗啉-4-基	H	H	羟基	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
518	H	氧杂环丁烷-3-基 甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
519	H	(3rac)-吡咯烷-3-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
520	H	1-(二氟甲基)-1H-吡啶-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
521	H	吗啉-4-基	H	H	羟基	H	2,3-二氯-5-羟基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
522	H	二甲基氨基	甲基	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
523	H	二甲基氨基	甲基	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
524	H	二甲基氨基	甲基	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
525	H	乙基(甲基)氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
526	H	异丙基(甲基)氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
527	H	乙基(甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
528	H	二甲基氨基	H	氨基	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
529	H	二甲基氨基	H	氨基	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
530	H	吗啉-4-基	H	H	H	甲氧基	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
531	H	吗啉-4-基	H	H	H	氟	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
532	H	吗啉-4-基	H	H	H	氟	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
533	H	吗啉-4-基	H	H	H	氟	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
534	H	异丙基(甲基)氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
535	H	甲氧基(甲基)氨基	H	氟	H	H	2,6-二氯吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
536	H	吗啉-4-基	H	氨基	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
537	H	吗啉-4-基	H	氨基	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
538	H	吗啉-4-基	H	氨基	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
539	H	氧杂环己烷-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
540	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	3,4,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
541	H	甲基氨基	H	氟	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1822]

542	H	甲基氨基	H	氟	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
543	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	2,5-二氟-3-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
544	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	2,5-二甲基-3-噻吩基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
545	H	甲基氨基	H	氟	H	H	2,6-二氟吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
546	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	4-(二氟甲氧基)-3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
547	H	甲基氨基	H	氟	H	H	4-(二氟甲氧基)-3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
548	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	2,3-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
549	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	2,3,4-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
550	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	2,6-二氟吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
551	H	二甲基氨基	H	氨基	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
552	H	甲基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
553	H	吗啉-4-基	H	氯	H	H	2,6-二氯吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
554	H	甲基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
555	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(1rac)-1-甲基-3,4-二氢-2H-萘-1-基
556	H	吗啉-4-基	H	氯	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
557	H	吗啉-4-基	H	氯	H	H	3-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
558	H	吗啉-4-基	H	氯	H	H	3-(三氟甲基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
559	H	二甲基氨基	H	羟基	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
560	H	二甲基氨基	H	羟基	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
561	H	二甲基氨基	H	羟基	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
562	H	4-氧代咪唑烷-1-基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
563	H	4-氧代咪唑烷-1-基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
564	H	吗啉-4-基	H	氯	H	H	3-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
565	H	吗啉-4-基	H	氯	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
566	H	2-羟基乙基氨基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
567	H	2-羟基乙基氨基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1823]

568	H	2-羟基乙基氨基	H	H	H	H	2,6-二氯吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
569	H	4-氧代咪唑烷-1-基	H	H	H	H	3-(三氟甲氧基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
570	H	乙基	H	H	H	H	3-(三氟甲氧基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
571	H	甲基	H	H	H	H	3-(三氟甲氧基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
572	H	甲基	H	H	H	H	2,3,5-三氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
573	H	乙基	H	H	H	H	2,3,5-三氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
574	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二乙基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
575	H	乙基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
576	H	吗啉-4-基	H	氟	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
577	H	2-羟基乙基氨基	H	氟	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
578	H	2-羟基乙基氨基	H	氟	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
579	H	2-羟基乙基氨基	H	氟	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
580	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4rac)-6-溴苯并二氢吡喃-4-基
581	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4rac)-3,4-二氢-1H-异色烯-4-基
582	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2-氯-3,5-二乙基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
583	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2-氯-3,5-二乙基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
584	H	吗啉-4-基	H	羟基	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
585	H	二甲基氨基羰基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
586	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-叔丁基-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
587	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3-叔丁基-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
588	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3,5-二乙基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
589	H	2-羟基乙基(甲基)氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
590	H	2-羟基乙基(甲基)氨基	H	H	H	H	2,3,5-三氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
591	H	2-羟基乙基(甲基)氨基	H	H	H	H	2,6-二氯吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
592	H	羟基甲基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
593	H	2-羟基乙基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1824]

594	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	3-氰基-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
595	H	甲基-[-(3rac)-氧杂环戊烷-3-基]甲基氨基	H	氟	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
596	H	2-(1H-吡唑-1-基)乙基氨基	H	氟	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
597	H	2-羟基乙基氨基	H	氟	H	H	2,6-二氯吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
598	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3-氰基-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
599	H	2-(1H-咪唑-1-基)乙基氨基	H	氟	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
600	H	甲基	H	H	H	H	2-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
601	H	二甲基氨基	H	H	H	H	5-叔丁基-2-氯-3-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
602	H	4-氧代咪唑烷-1-基	H	H	H	H	2-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
603	H	乙基	H	H	H	H	2-氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
604	H	4-氧代咪唑烷-1-基	H	H	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
605	H	甲基	H	H	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
606	H	2-羟基乙基(甲基)氨基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
607	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	5-叔丁基-2-氯-3-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
608	H	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,3-二氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
609	H	吗啉-4-基	H	三氟甲氧基	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
610	H	吗啉-4-基	H	三氟甲氧基	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
611	H	吗啉-4-基	H	三氟甲氧基	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
612	H	二甲基氨基	H	三氟甲氧基	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
613	H	二甲基氨基	H	三氟甲氧基	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
614	H	二甲基氨基	H	三氟甲氧基	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
615	H	吗啉-4-基	H	羟基	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1825]

616	H	吗啉-4-基	H	羟基	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
617	H	二甲基氨基	H	氟基	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
618	H	二甲基氨基	H	H	羟基	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
619	H	二甲基氨基	H	H	羟基	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
620	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4rac)-8-氟苯并二氢吡喃-4-基
621	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4rac)-6,8-二氯苯并二氢吡喃-4-基
622	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4rac)-6-氯苯并二氢吡喃-4-基
623	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4rac)-6-氟苯并二氢吡喃-4-基
624	H	二甲基氨基	H	H	H	H	2,3-二氯-5-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
625	H	2-(1H-咪唑-1-基)乙基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
626	H	吗啉-4-基	H	H	羟基	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
627	H	吗啉-4-基	H	H	羟基	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
628	H	乙基	H	H	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
629	H	甲基氨基	H	氯	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
630	H	吗啉-4-基	H	氯	H	H	3,5-二氯苯基	(1rac)-3,3-二甲基茚满-1-基
631	H	[乙酰基(甲基)氨基]甲基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
632	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4rac)-8-氯苯并二氢吡喃-4-基
633	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4rac)-6,8-二氯苯并二氢吡喃-4-基
634	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4rac)-8-溴苯并二氢吡喃-4-基
635	H	吗啉-4-基	H	氯	H	H	3,5-二氯苯基	(1rac)-3-氧代茚满-1-基
636	H	甲基氨基	H	氯	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
637	H	乙基氨基	H	氟	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
638	H	乙基氨基	H	氟	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
639	H	乙基氨基	H	氟	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
640	H	乙基氨基	H	氟	H	H	2,6-二氯吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1826]

641	H	2-乙酰基氧基乙基氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
642	H	吗啉-4-基	H	氰基	H	H	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
643	H	2-(二甲基氨基)乙基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
644	H	2-(1H-咪唑-1-基)乙基-甲基氨基	H	氟	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
645	H	甲基	H	H	H	H	2-氯-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
646	H	乙基	H	H	H	H	2-氯-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
647	H	甲基(2-甲基磺酰基乙基)氨基	H	氟	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
648	H	3-氟氮杂环丁烷-1-基	H	氟	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
649	H	2-羟基乙基(甲基)氨基	H	氟	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
650	H	(3-甲氧基-3-氧代丙基)-甲基氨基	H	氟	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
651	H	吗啉-4-基	H	H	H	氰基	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
652	H	吗啉-4-基	H	氰基	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
653	H	3,6-二氢-2H-吡喃-4-基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
654	H	1,3-二甲基-2,4-二氧代-1,2,3,4-四氢嘧啶-5-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
655	H	乙基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
656	H	二甲基氨基	H	H	H	H	5-氯-1H-咪唑-2-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
657	H	吗啉-4-基	H	H	H	氰基	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
658	H	二甲基氨基	H	H	H	氰基	5-氯-2-氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
659	H	二甲基氨基	H	H	H	氰基	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
660	H	氧杂环丁烷-3-基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
661	H	甲基(2-甲基磺酰基乙基)氨基	H	氟	H	H	2,6-二氯吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
662	H	碘	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
663	H	吗啉-4-基	H	H	H	氰基	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
664	H	二甲基氨基	H	H	H	氰基	3,5-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
665	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基	(4rac)-8-氟-3,4-二氢-1H-异色烯-4-基

[1827]

666	H	2-羟基乙基(甲基)氨基	H	氟	H	H	3,5-二氟苯基	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
667	H	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基	(1rac)-3-氧代茚满-1-基
668	H	二甲基氨基	H	氯	H	H	2,6-二氯吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
669	H	二甲基氨基	H	氯	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
670	H	二甲基氨基	H	氯	H	H	3-叔丁基-5-甲基苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
671	H	二甲基氨基	H	氯	H	H	3-(三氟甲基)苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
672	H	二甲基氨基	H	氯	H	H	3,5-二甲苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
673	H	2-(1H-吡唑-1-基)乙基氨基	H	氟	H	H	2,6-二氯吡啶-4-基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
674	H	2-羟基乙基(甲基)氨基	H	氯	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
676	H	乙基	H	H	H	H	2,5-二甲苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
677	H	(3rac)-吡咯烷-3-基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
678	H	(3rac)-四氢咪唑-3-基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
679	H	1-甲基-哌啶-4-基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
680	H	吗啉-4-基	H	H	H	羟基	2,3-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
681	H	吗啉-4-基	H	H	H	羟基	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
682	H	二甲基氨基	H	H	H	羟基	2,3-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
683	H	二甲基氨基	H	H	H	羟基	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
684	H	异丙基	H	氟	H	H	2,5-二甲苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
685	H	甲基	H	H	H	H	2,5-二甲苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
686	H	甲氧基甲基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
687	H	乙基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
688	H	乙基	H	H	H	H	2,3,4-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
689	H	吗啉-4-基	H	氟	H	氟	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
690	H	二甲基氨基	H	氟	H	氟	2,3,5-三氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
691	H	吗啉-4-基	H	氟	H	氟	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
692	H	二甲基氨基	H	氟	H	氟	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1828]	693	H	吗啉-4-基	H	氟	H	氟	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
	694	H	二甲基氨基	H	氟	H	氟	2,3-二氯苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
	695	H	甲基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1829] 表2: LC-MS和NMR数据

[1830] 当NMR峰形式出现在光谱中时对其进行表述,未考虑可能的更高阶的效应。

[1831] NMR峰值列表

[1832] 所选实施例的¹H-NMR数据以¹H-NMR峰值列表的形式写出。对每个信号峰列出以ppm为单位的 δ -值和在大括号中的信号强度。在 δ -值-信号强度对之间是分号或逗号作为分隔符。

[1833] 实施例的峰值列表因此具有以下形式:

[1834] δ_1 (强度₁); δ_2 (强度₂); ……; δ_i (强度_i); ……; δ_n (强度_n) 或

[1835] δ_1 (强度₁), δ_2 (强度₂), ……; δ_i (强度_i), ……; δ_n (强度_n)。

[1836] 尖锐信号的强度与以cm为单位的NMR光谱的图谱实施例中的信号高度相关,并显示信号强度的实际关系。由宽信号可以示出与光谱中最强的信号相比,信号的几个峰或中央以及它们的相对强度。

[1837] 为了校准¹H光谱的化学位移,我们使用四甲基硅烷和/或所用溶剂的化学位移,特别是在DMSO中测量光谱的情况下。因此,在NMR峰值列表中,四甲基硅烷峰可能出现但不是必需的。

[1838] ¹H-NMR峰值列表与经典的¹H-NMR图谱类似,并因此通常包含所有峰,其在经典的NMR说明中列出。

[1839] 另外,它们可以显示溶剂、目标化合物(也是本发明的主题)的立体异构体和/或杂质峰的经典¹H-NMR图谱信号。

[1840] 为了显示溶剂和/或水的 δ -范围内的化合物信号,溶剂的常见峰,例如DMSO-D₆中的DMSO峰和水的峰显示在我们的¹H-NMR峰值列表中并且通常具有平均高强度。

[1841] 目标化合物的立体异构体的峰和/或杂质的峰通常具有平均比目标化合物峰低的强度(例如对于> 90%的纯度)。

[1842] 这种立体异构体和/或杂质对于特定的制备方法可能是典型的。因此,它们的峰有助于通过“副产品 - 指纹图谱”识别我们的制备过程的再现。

[1843] 用已知方法(MestreC, ACD模拟,但也用经验评估的期望值)计算目标化合物峰的专家可以在需要时选用额外的强度过滤器分离目标化合物的峰。该分离将类似于经典¹H-NMR说明的相关峰选择。

[1844] 有关峰值列表的NMR数据描述的更多详细信息,请参见Research Disclosure Database Number 564025的出版物“Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications”。

[1845]

实施例 编号	logP (方法 L0) ^(a)	LC-MS (方法 L2-L5)	NMR或NMR 峰值列表(peaklist)
1		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.42 min, MS (ESIpos): m/z = 440 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (4.41), 0.008 (4.06), 2.342 (16.00), 2.759 (1.07), 7.059 (1.60), 7.111 (0.66), 7.128 (1.05), 7.183 (4.61), 7.195 (1.69), 7.202 (0.82), 7.207 (0.96), 7.422 (0.89), 7.438 (0.75), 7.855 (4.02), 7.865 (2.24), 7.869 (2.26), 8.303 (1.26), 8.314 (1.10), 8.317 (1.07), 8.328 (1.10), 8.874 (5.11), 9.102 (0.96), 9.123 (0.96).
2		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.47 min, MS (ESIpos): m/z = 481 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (3.38), 1.805 (1.14), 1.836 (2.05), 1.854 (1.44), 1.862 (1.41), 1.867 (1.25), 1.879 (1.41), 1.887 (1.60), 1.910 (1.44), 1.932 (1.44), 1.946 (1.07), 1.960 (0.93), 2.045 (1.14), 2.069 (1.54), 2.080 (1.05), 2.088 (1.03), 2.746 (1.96), 2.760 (3.96), 2.771 (3.46), 2.787 (1.53), 3.289 (3.24), 5.230 (0.89), 5.248 (1.82), 5.265 (1.70), 5.281 (0.81), 7.111 (2.30), 7.128 (3.40), 7.161 (1.10), 7.166 (1.44), 7.179 (3.34), 7.184 (3.63), 7.190 (3.11), 7.196 (4.53), 7.202 (2.62), 7.208 (2.92), 7.212 (2.70), 7.226 (0.95), 7.422 (3.20), 7.439 (2.63), 7.444 (2.24), 7.675 (7.89), 7.679 (16.00), 7.683 (9.38), 7.687 (5.20), 7.692 (1.77), 7.889 (2.30), 7.907 (3.45), 7.909 (4.06), 7.928 (3.18), 7.989 (3.67), 8.002 (4.95), 8.017 (2.68), 8.020 (3.30), 8.383 (3.21), 8.386 (4.14), 8.404 (2.94), 8.407 (3.59), 8.940 (10.21), 9.119 (3.46), 9.141 (3.28).
3		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.37 min, MS (ESIpos): m/z = 467 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (1.33), 1.234 (2.20), 1.397 (0.85), 1.924 (1.63), 1.935 (0.83), 1.946 (1.76), 1.956 (1.90), 1.967 (0.79), 1.977 (1.84), 1.998 (0.66), 2.524 (2.18), 2.567 (0.88), 2.575 (0.77), 2.838 (0.77), 2.859 (1.28), 2.878 (2.28), 2.898 (2.50), 2.918 (1.19), 2.951 (1.54), 2.959 (1.64), 2.973 (1.71), 2.980 (1.81), 2.990 (0.99), 2.999 (0.88), 3.012 (0.86), 3.020 (0.74), 3.070 (1.91), 5.542 (1.02), 5.562 (2.83), 5.582 (2.79), 5.602 (0.92), 7.223 (0.96), 7.232 (4.00), 7.240 (4.95), 7.246 (5.24), 7.254 (7.15), 7.263 (2.96), 7.271 (3.67), 7.281 (2.50), 7.293 (1.17), 7.435 (2.55), 7.446 (2.61), 7.456 (2.00), 7.635 (1.10), 7.665 (0.98), 7.678 (13.08), 7.681 (16.00), 7.686 (7.10), 7.689 (3.73), 7.695 (1.37), 7.700 (0.80), 7.895 (2.06), 7.913 (4.25), 7.934 (3.06), 8.004 (4.66), 8.008 (3.27), 8.022 (3.28), 8.026 (2.07), 8.393 (4.14), 8.396 (2.75), 8.414 (3.73), 8.417 (2.39), 8.962 (10.00), 9.118 (3.31), 9.139 (3.23).
4		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.33 min, MS (ESIpos): m/z = 483 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (2.60), 0.833 (1.52), 0.839 (3.28), 0.855 (3.89), 0.859 (2.26), 0.871 (1.10), 0.876 (0.82), 1.106 (9.55), 1.157 (1.22), 1.175 (2.15), 1.193 (1.15), 1.988 (3.86), 2.058 (0.88), 2.066 (0.96), 2.076 (1.10), 2.086 (2.40), 2.093 (1.49), 2.100 (1.27), 2.109 (0.88), 2.196 (0.93), 2.208 (1.32), 2.221 (1.22), 2.229 (1.16), 2.243 (0.82), 3.076 (2.73), 3.288 (3.01), 4.021 (0.91), 4.038 (0.91), 4.221 (0.77), 4.241 (2.10), 4.249 (1.66), 4.261 (2.02), 4.270 (2.60), 4.279 (2.07), 4.287 (1.71), 4.296 (1.82), 5.266 (0.85), 5.281 (1.90), 5.301 (1.91), 5.315 (0.88), 6.789 (3.17), 6.791 (3.20), 6.809 (3.59), 6.812 (3.55), 6.916 (1.71), 6.918 (1.65), 6.934 (3.51), 6.937 (3.37), 6.953 (2.16), 6.956 (1.99), 7.157 (1.74), 7.162 (1.79), 7.179 (2.96), 7.196 (1.43), 7.200 (1.40), 7.379 (3.11), 7.398 (2.90), 7.676 (7.53), 7.680 (16.00), 7.685 (7.22), 7.688 (4.08), 7.694 (1.49), 7.893 (2.34), 7.911 (3.81), 7.914 (3.22), 7.932 (3.47), 8.006 (4.05), 8.010 (4.08), 8.024 (3.07), 8.027 (2.79), 8.387 (3.53), 8.390 (3.48), 8.408 (3.33), 8.411 (3.06), 8.962 (10.68), 9.251 (3.18), 9.272 (3.11).

[1846]

5	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.24 min, MS (ESIpos): m/z = 449 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (3.48), 0.008 (3.53), 1.157 (0.87), 1.175 (1.69), 1.192 (0.90), 1.988 (2.96), 2.058 (0.97), 2.066 (1.02), 2.075 (1.14), 2.082 (1.14), 2.093 (1.62), 2.100 (1.34), 2.108 (0.97), 2.196 (1.00), 2.209 (1.44), 2.222 (1.34), 2.231 (1.27), 3.289 (3.14), 4.021 (0.70), 4.038 (0.70), 4.221 (0.87), 4.241 (2.39), 4.249 (1.84), 4.261 (2.26), 4.269 (2.89), 4.279 (2.24), 4.287 (1.79), 4.296 (2.04), 5.268 (0.95), 5.282 (2.07), 5.302 (2.07), 5.318 (0.95), 6.788 (3.63), 6.791 (4.03), 6.809 (4.26), 6.811 (4.43), 6.915 (2.02), 6.918 (2.07), 6.934 (4.08), 6.937 (4.13), 6.952 (2.54), 6.956 (2.41), 7.157 (2.04), 7.161 (2.19), 7.178 (3.28), 7.196 (1.67), 7.200 (1.59), 7.378 (3.31), 7.398 (3.16), 7.491 (1.37), 7.496 (1.05), 7.506 (3.83), 7.510 (10.25), 7.515 (4.63), 7.529 (6.47), 7.549 (2.34), 7.572 (3.11), 7.577 (5.20), 7.581 (2.86), 7.589 (1.84), 7.593 (2.59), 7.598 (1.67), 7.675 (2.91), 7.679 (6.05), 7.684 (3.38), 7.887 (2.84), 7.905 (4.85), 7.908 (3.73), 7.926 (5.13), 7.958 (5.28), 7.962 (5.82), 7.976 (3.31), 7.979 (2.86), 8.362 (4.30), 8.366 (4.45), 8.383 (4.11), 8.387 (3.83), 8.934 (16.00), 9.244 (3.56), 9.265 (3.46).
6	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.31 min, MS (ESIpos): m/z = 433 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (3.23), 0.008 (3.14), 0.853 (0.88), 1.175 (2.40), 1.235 (4.21), 1.925 (1.92), 1.934 (0.91), 1.945 (1.99), 1.956 (2.12), 1.967 (0.92), 1.976 (2.11), 1.998 (0.79), 2.517 (2.33), 2.525 (2.38), 2.568 (0.89), 2.859 (1.26), 2.878 (1.91), 2.899 (2.60), 2.919 (1.22), 2.951 (1.61), 2.959 (1.75), 2.973 (1.77), 2.981 (1.65), 2.990 (0.94), 2.999 (0.87), 3.287 (2.04), 5.544 (1.02), 5.564 (3.03), 5.584 (3.00), 5.604 (0.98), 5.754 (7.31), 6.510 (1.69), 7.232 (5.18), 7.241 (5.18), 7.246 (6.49), 7.255 (9.27), 7.264 (2.87), 7.272 (3.87), 7.281 (2.34), 7.285 (1.99), 7.294 (1.18), 7.434 (2.78), 7.447 (2.68), 7.456 (2.20), 7.488 (0.77), 7.492 (1.58), 7.497 (1.25), 7.507 (4.17), 7.512 (9.71), 7.515 (6.13), 7.517 (5.24), 7.531 (6.56), 7.551 (2.46), 7.574 (3.40), 7.579 (5.63), 7.584 (3.06), 7.592 (1.94), 7.596 (2.78), 7.601 (1.72), 7.676 (3.20), 7.678 (3.96), 7.680 (6.36), 7.685 (3.54), 7.889 (3.03), 7.907 (5.37), 7.910 (3.81), 7.928 (5.57), 7.957 (5.81), 7.961 (6.39), 7.975 (3.50), 7.979 (2.97), 8.368 (4.68), 8.372 (4.77), 8.389 (4.45), 8.393 (4.06), 8.935 (16.00), 9.113 (3.64), 9.134 (3.51).
7	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.24 min, MS (ESIpos): m/z = 483 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (3.31), 0.852 (0.82), 1.142 (0.91), 1.157 (1.29), 1.172 (2.28), 1.175 (2.52), 1.192 (1.46), 1.234 (5.59), 1.394 (15.65), 1.398 (16.00), 1.985 (3.80), 1.988 (4.30), 2.039 (2.93), 2.046 (3.13), 2.057 (3.86), 2.064 (3.92), 2.074 (5.03), 2.082 (7.46), 2.086 (6.64), 2.090 (3.57), 2.098 (2.57), 2.185 (3.22), 2.196 (4.56), 2.207 (4.45), 2.218 (4.15), 2.230 (3.16), 2.242 (2.40), 2.251 (1.61), 2.365 (0.76), 2.707 (0.88), 3.288 (5.56), 4.020 (1.05), 4.038 (1.02), 4.204 (2.11), 4.232 (5.79), 4.259 (7.69), 4.268 (7.31), 4.276 (6.03), 4.285 (6.49), 4.296 (2.90), 4.304 (2.52), 4.312 (1.99), 5.251 (2.66), 5.266 (6.52), 5.285 (7.14), 5.300 (3.71), 6.781 (12.26), 6.788 (2.84), 6.801 (13.54), 6.809 (3.01), 6.903 (5.41), 6.922 (11.79), 6.940 (7.05), 6.953 (1.43), 7.150 (6.38), 7.170 (10.21), 7.189 (4.94), 7.363 (10.65), 7.383 (15.97), 7.403 (10.71), 7.456 (7.17), 7.475 (11.58), 7.495 (5.62), 7.511 (3.80), 7.528 (2.19), 7.548 (0.88), 7.573 (1.93), 7.590 (1.14), 7.677 (2.72), 7.720 (7.52), 7.723 (13.02), 7.727 (7.34), 7.740 (6.82), 7.743 (11.14), 7.747 (6.20), 7.845 (5.00), 7.849 (8.98), 7.852 (5.56), 7.863 (9.83), 7.866 (15.94), 7.870 (9.04), 7.883 (1.11), 7.898 (8.89), 7.902 (9.54), 7.919 (13.05), 7.923 (10.44), 7.937 (5.59), 7.940 (5.21), 7.958 (2.72), 7.976 (1.43), 8.362 (2.05), 8.383 (2.05), 8.397 (12.37), 8.418 (11.26), 8.854 (13.98), 8.860 (14.48), 8.932 (4.65), 9.245 (6.76), 9.254 (6.38), 9.266 (7.08), 9.275 (5.79).
8	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.06 min, MS (ESIpos): m/z = 492 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (1.11), 0.008 (1.00), 3.066 (16.00), 3.071 (4.46), 3.287 (1.77), 3.926 (1.28), 4.269 (0.87), 6.795 (0.90), 6.788 (0.97), 6.805 (1.03), 6.808 (1.03), 6.925 (0.97), 6.928 (0.93), 6.944 (0.61), 6.947 (0.58), 7.171 (0.77), 7.359 (0.80), 7.378 (0.74), 7.629 (1.51), 7.634 (12.99), 7.647 (1.14), 7.650 (0.96), 7.668 (0.99), 7.790 (1.13), 7.793 (1.20), 7.807 (0.93), 7.811 (0.88), 8.229 (1.01), 8.233 (1.03), 8.251 (0.94), 8.254 (0.89), 8.632 (3.95), 9.084 (0.86), 9.105 (0.84).

[1847]

9	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.04 min; MS (ESIpos): m/z = 476 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.94), 0.008 (2.72), 2.323 (0.52), 2.710 (0.57), 3.070 (16.00), 3.286 (4.49), 3.567 (0.42), 5.534 (0.73), 7.220 (1.05), 7.235 (1.05), 7.242 (1.91), 7.267 (0.89), 7.630 (1.27), 7.636 (12.76), 7.648 (1.00), 7.670 (0.93), 7.788 (1.11), 7.792 (1.16), 7.806 (0.97), 8.232 (1.08), 8.253 (0.95), 8.638 (4.07), 8.941 (0.86), 8.962 (0.79).
10	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.69 min; MS (ESIpos): m/z = 476 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.60), 0.008 (1.51), 2.326 (13.07), 3.055 (16.00), 3.288 (3.31), 6.784 (0.87), 6.787 (0.95), 6.804 (1.02), 6.807 (1.05), 6.922 (0.96), 6.925 (0.93), 6.940 (0.61), 6.943 (0.58), 7.009 (1.28), 7.147 (3.19), 7.584 (0.61), 7.601 (1.16), 7.604 (0.75), 7.622 (1.25), 7.640 (1.28), 7.645 (1.45), 7.658 (0.73), 8.150 (0.99), 8.154 (0.99), 8.170 (0.93), 8.175 (0.84), 8.581 (4.01), 9.069 (0.84), 9.090 (0.81).
11	LC-MS (方法 L7): Rt = 2.58 min; MS (ESIpos): m/z = 490 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.007 (1.04), 0.007 (1.04), 2.568 (6.31), 3.046 (16.00), 3.286 (1.53), 5.532 (0.72), 5.548 (0.72), 7.220 (1.16), 7.224 (0.84), 7.228 (1.19), 7.233 (1.07), 7.238 (1.68), 7.266 (0.89), 7.403 (0.73), 7.623 (0.69), 7.627 (1.62), 7.631 (1.75), 7.641 (5.09), 7.645 (3.28), 7.664 (1.62), 7.667 (1.70), 8.012 (1.49), 8.014 (1.50), 8.016 (1.25), 8.578 (3.50), 8.934 (0.95), 8.951 (0.93).
12	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.18 min; MS (ESIpos): m/z = 506 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (3.00), 0.008 (2.59), 2.566 (6.36), 3.042 (16.00), 3.287 (1.44), 4.270 (0.90), 5.754 (4.48), 6.785 (1.08), 6.806 (1.12), 6.923 (1.03), 6.942 (0.64), 7.168 (0.84), 7.351 (0.82), 7.371 (0.78), 7.621 (0.71), 7.626 (1.60), 7.630 (2.09), 7.639 (6.13), 7.644 (3.08), 7.665 (1.73), 7.670 (1.76), 8.012 (1.45), 8.572 (3.85), 9.076 (0.91), 9.096 (0.91).
13	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.05 min; MS (ESIpos): m/z = 510 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.31), 0.008 (1.23), 3.065 (16.00), 4.270 (0.87), 6.785 (0.94), 6.788 (1.04), 6.806 (1.05), 6.809 (1.12), 6.926 (0.98), 6.929 (0.96), 6.944 (0.62), 7.171 (0.78), 7.377 (0.73), 7.628 (0.81), 7.646 (1.07), 7.650 (0.98), 7.668 (1.02), 7.802 (4.91), 7.806 (1.58), 7.818 (4.35), 7.824 (1.06), 8.227 (1.02), 8.231 (1.06), 8.249 (0.95), 8.252 (0.89), 8.636 (4.18), 9.087 (0.78), 9.108 (0.78).
14	LC-MS (方法 L7): Rt = 2.39 min; MS (ESIpos): m/z = 518 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氟仿 -d) δ [ppm]: -0.008 (1.09), 0.008 (1.14), 1.562 (5.12), 2.082 (1.48), 2.090 (1.98), 2.098 (3.67), 2.107 (2.27), 2.116 (1.78), 2.588 (16.00), 4.031 (2.54), 4.248 (1.04), 4.259 (1.53), 4.270 (1.04), 6.783 (0.82), 7.213 (0.97), 7.232 (0.93), 7.348 (4.36), 7.353 (5.19), 7.377 (0.81), 7.525 (1.06), 7.530 (1.97), 7.535 (1.20), 7.571 (0.87), 7.590 (1.42), 7.611 (1.29), 7.676 (1.58), 7.679 (1.69), 7.694 (1.17), 7.697 (1.10), 8.088 (1.16), 8.171 (1.22), 8.193 (1.14).
15	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.55 min; MS (ESIpos): m/z = 452 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.60), 0.008 (1.51), 2.326 (13.07), 3.055 (16.00), 3.288 (3.31), 6.784 (0.87), 6.787 (0.95), 6.804 (1.02), 6.807 (1.05), 6.922 (0.96), 6.925 (0.93), 6.940 (0.61), 6.943 (0.58), 7.009 (1.28), 7.147 (3.19), 7.584 (0.61), 7.601 (1.16), 7.604 (0.75), 7.622 (1.25), 7.640 (1.28), 7.645 (1.45), 7.658 (0.73), 8.150 (0.99), 8.154 (0.99), 8.170 (0.93), 8.175
16	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.26 min; MS (ESIpos): m/z = 490 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.756 (0.89), 2.770 (0.83), 3.070 (16.00), 7.124 (0.88), 7.173 (0.86), 7.177 (0.86), 7.190 (1.17), 7.202 (0.75), 7.207 (0.69), 7.389 (0.77), 7.627 (1.23), 7.632 (11.18), 7.645 (1.06), 7.648 (0.95), 7.666 (0.97), 7.783 (1.07), 7.787 (1.17), 7.801 (0.91), 7.805 (0.87), 8.228 (1.01), 8.232 (1.03), 8.250 (0.94), 8.253 (0.90), 8.608 (3.86), 8.972 (0.87), 8.993 (0.85).

[1848]

17	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.24 min; MS (ESIpos): m/z = 534 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (1.02), 0.008 (0.92), 1.169 (0.67), 3.268 (1.80), 3.280 (4.39), 3.287 (5.64), 3.865 (3.30), 3.877 (5.67), 3.889 (3.15), 4.244 (1.15), 4.252 (0.88), 4.265 (1.45), 4.276 (1.35), 4.283 (0.98), 4.292 (0.96), 5.255 (1.02), 5.275 (1.02), 6.786 (1.88), 6.789 (2.08), 6.807 (2.18), 6.810 (2.27), 6.915 (1.06), 6.918 (1.05), 6.934 (2.10), 6.937 (2.04), 6.952 (1.32), 6.955 (1.28), 7.153 (1.06), 7.158 (1.11), 7.175 (1.66), 7.192 (0.85), 7.196 (0.84), 7.380 (1.77), 7.399 (1.67), 7.633 (2.13), 7.636 (4.66), 7.639 (16.00), 7.643 (3.34), 7.682 (1.63), 7.689 (2.18), 7.703 (1.97), 7.721 (2.07), 7.830 (2.42), 7.834 (2.58), 7.848 (2.01), 7.851 (1.90), 8.276 (2.01), 8.280 (2.07), 8.297 (1.93), 8.301 (1.76), 8.699 (8.76), 9.164 (1.90), 9.184 (1.86).
18	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.77 min; MS (ESIpos): m/z = 506 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.30), 0.008 (2.10), 2.037 (0.83), 2.168 (0.72), 2.180 (0.72), 2.262 (16.00), 3.070 (2.04), 4.217 (0.95), 4.243 (1.45), 4.252 (1.36), 4.259 (1.09), 4.268 (1.06), 5.207 (0.94), 5.226 (0.92), 6.779 (1.82), 6.800 (1.99), 6.881 (1.11), 6.884 (1.13), 6.900 (2.29), 6.903 (2.22), 6.919 (1.39), 6.922 (1.31), 7.140 (0.97), 7.144 (1.05), 7.161 (1.67), 7.179 (0.84), 7.183 (0.82), 7.323 (2.16), 7.343 (1.95), 7.569 (0.80).
19	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.81 min; MS (ESIpos): m/z = 490 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (1.93), 0.008 (1.79), 1.879 (0.89), 1.899 (0.96), 1.908 (1.37), 1.930 (1.00), 2.261 (16.00), 2.832 (0.71), 2.851 (0.96), 2.871 (1.31), 2.940 (0.83), 2.949 (0.89), 2.962 (0.93), 2.971 (0.90), 3.081 (2.10), 5.500 (1.37), 5.520 (1.38), 7.201 (1.33), 7.207 (2.03), 7.215 (3.05), 7.223 (2.67), 7.230 (2.32), 7.243 (0.97), 7.248 (0.89), 7.258 (2.20), 7.274 (1.48), 7.280 (1.39), 7.361 (1.57), 7.368 (1.60), 7.383 (1.37), 7.546 (0.94), 7.568 (1.01).
20	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.32 min; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.149 (1.09), 1.837 (2.38), 2.069 (1.99), 2.757 (4.80), 3.878 (12.72), 5.231 (2.34), 7.125 (3.98), 7.180 (3.90), 7.197 (4.92), 7.213 (3.63), 7.411 (3.59), 7.428 (3.24), 7.636 (16.00), 7.680 (2.42), 7.698 (3.79), 7.718 (2.69), 7.826 (4.25), 7.842 (3.43), 8.280 (3.71), 8.300 (3.40), 8.673 (8.04), 9.047 (3.28), 9.067 (3.16).
21	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.20 min; MS (ESIpos): m/z = 494 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 3.071 (16.00), 5.515 (0.74), 5.535 (0.74), 7.213 (1.11), 7.222 (1.33), 7.230 (1.61), 7.234 (1.34), 7.251 (0.99), 7.381 (0.72), 7.389 (0.77), 7.495 (2.53), 7.500 (2.65), 7.584 (0.68), 7.607 (1.36), 7.630 (0.72), 7.679 (0.71), 7.684 (1.25), 7.689 (0.68), 8.280 (0.72), 8.295 (0.78), 8.304 (0.76), 8.319 (0.70), 8.607 (3.29), 8.927 (0.97), 8.948 (0.95).
22	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.26 min; MS (ESIpos): m/z = 510 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 3.067 (16.00), 4.249 (0.91), 4.258 (0.94), 6.779 (0.92), 6.782 (1.01), 6.800 (1.06), 6.803 (1.10), 6.912 (1.02), 6.915 (1.03), 6.931 (0.61), 7.165 (0.86), 7.339 (0.87), 7.358 (0.82), 7.494 (2.71), 7.499 (2.71), 7.584 (0.72), 7.607 (1.42), 7.630 (0.77), 7.677 (0.88), 7.682 (1.54), 7.687 (0.82), 8.278 (0.75), 8.294 (0.81), 8.302 (0.81), 8.318 (0.73), 8.600 (3.49), 9.066 (0.94), 9.087 (0.93).
23	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.8/ min; MS (ESIpos): m/z = 496 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (1.58), -0.008 (15.27), 0.008 (13.12), 0.146 (1.58), 2.154 (1.98), 2.367 (2.04), 2.709 (1.98), 3.054 (12.95), 3.067 (11.82), 4.260 (5.48), 5.250 (2.09), 6.782 (4.01), 6.803 (4.13), 6.895 (1.92), 6.910 (3.67), 6.928 (2.37), 7.160 (2.83), 7.308 (3.11), 7.325 (2.94), 7.517 (2.49), 7.535 (3.73), 7.556 (3.00), 7.732 (4.18), 7.746 (3.45), 7.784 (14.53), 7.801 (16.00), 8.339 (3.17), 8.360 (3.05), 8.453 (11.82), 8.966 (3.17), 8.987 (3.22).

[1849]

24	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.86 min; MS (ES/pos): m/z = 478 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (1.23), -0.008 (10.75), 0.008 (11.29), 0.146 (1.26), 0.850 (1.36), 0.868 (0.82), 2.046 (1.11), 2.061 (1.08), 2.140 (1.17), 2.154 (1.33), 3.055 (9.80), 3.067 (9.17), 3.287 (3.23), 4.246 (2.43), 4.259 (4.02), 4.274 (2.37), 5.230 (1.36), 5.250 (1.39), 6.778 (2.53), 6.781 (2.78), 6.799 (2.91), 6.802 (3.04), 6.891 (1.39), 6.894 (1.42), 6.909 (2.75), 6.912 (2.81), 6.928 (1.71), 6.931 (1.74), 7.140 (1.36), 7.144 (1.49), 7.161 (2.21), 7.179 (1.14), 7.183 (1.17), 7.305 (2.15), 7.324 (2.09), 7.516 (2.06), 7.534 (2.62), 7.537 (2.50), 7.555 (2.43), 7.595 (1.71), 7.599 (3.98), 7.604 (4.93), 7.615 (16.00), 7.620 (9.01), 7.713 (3.07), 7.716 (3.35), 7.730 (2.69), 7.734 (2.59), 7.792 (1.55), 7.805 (1.49), 8.336 (2.21), 8.340 (2.40), 8.358 (2.25), 8.362 (2.18), 8.446 (9.01), 8.988 (2.50), 8.989 (2.43).
25	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.08 min; MS (ES/pos): m/z = 500 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 3.282 (1.79), 3.293 (1.98), 3.311 (16.00), 6.807 (0.71), 6.932 (0.68), 7.468 (0.89), 7.474 (0.85), 7.493 (0.76), 7.540 (0.71), 7.643 (0.98), 7.780 (0.75), 8.673 (1.65).
26	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.07 min; MS (ES/pos): m/z = 515 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (4.85), 0.008 (4.19), 1.234 (0.78), 1.710 (0.76), 1.740 (0.93), 1.986 (1.09), 1.999 (1.07), 2.007 (1.05), 2.021 (0.85), 2.072 (1.71), 2.366 (0.62), 2.709 (0.62), 3.287 (4.75), 3.971 (0.74), 3.977 (0.87), 3.999 (1.86), 4.006 (1.18), 4.021 (1.22), 4.027 (0.93), 4.139 (1.24), 4.149 (1.14), 4.158 (1.40), 4.168 (0.85), 4.176 (0.89), 4.185 (0.68), 5.041 (0.74), 5.055 (1.65), 5.074 (1.65), 5.088 (0.72), 6.741 (3.06), 6.761 (3.39), 6.837 (1.45), 6.840 (1.45), 6.856 (3.14), 6.874 (1.94), 7.020 (2.31), 7.039 (1.88), 7.122 (1.63), 7.126 (1.53), 7.142 (2.64), 7.160 (1.30), 7.164 (1.22), 7.264 (5.35), 7.499 (5.93), 7.502 (6.65), 7.519 (3.45), 7.523 (3.34), 7.700 (5.90), 7.703 (16.00), 7.802 (2.44), 7.820 (3.22), 7.841 (2.46), 7.917 (3.72), 8.008 (3.14), 8.011 (3.53), 8.027 (2.79), 8.030 (2.85), 8.962 (2.87), 8.982 (2.79), 9.152 (10.38).
27	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.06 min; MS (ES/pos): m/z = 530 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 12.73 (br s, 1H), 9.01 (d, 1H), 8.69 (s, 1H), 8.46 (d, 1H), 8.30 (br d, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.41 - 7.62 (m, 4H), 7.07 - 7.36 (m, 8H), 5.39 - 5.60 (m, 2H), 2.90 - 3.07 (m, 2H), 2.73 - 2.88 (m, 2H), 2.57 - 2.69 (m, 1H), 2.53 - 2.71 (m, 13H), 2.30 - 2.44 (m, 1H), 2.09 (dq, 1H), 1.93 (dq, 1H).
28	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.09 min; MS (ES/pos): m/z = 564 [M+H] ⁺	
29	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.88 min; MS (ES/pos): m/z = 476 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 3.072 (16.00), 3.287 (1.21), 5.754 (0.68), 6.774 (0.89), 6.777 (0.93), 6.794 (1.01), 6.797 (0.99), 6.905 (0.97), 6.908 (0.91), 6.923 (0.62), 7.303 (0.79), 7.311 (0.71), 7.324 (0.64), 7.332 (1.23), 7.579 (0.65), 7.633 (3.39), 7.641 (1.60), 7.651 (1.51), 8.240 (1.01), 8.247 (0.94), 8.258 (0.82), 8.265 (0.85), 8.531 (4.23), 9.073 (0.80), 9.093 (0.77).
30	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.88 min; MS (ES/pos): m/z = 460 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.71), 3.063 (16.00), 4.262 (0.82), 4.270 (0.92), 6.784 (0.87), 6.787 (0.95), 6.805 (1.03), 6.808 (1.04), 6.924 (0.98), 6.927 (0.96), 6.943 (0.63), 6.946 (0.58), 7.171 (0.79), 7.351 (0.81), 7.370 (0.78), 7.496 (0.70), 7.523 (0.72), 7.620 (0.81), 7.637 (1.13), 7.641 (1.00), 7.659 (1.13), 7.751 (1.16), 7.754 (1.21), 7.768 (0.93), 7.772 (0.86), 8.201 (1.03), 8.205 (1.05), 8.222 (0.98), 8.226 (0.90), 8.613 (3.83), 9.077 (0.87), 9.097 (0.85).

[1850]

31		LC-MS (方法 L1): Rt = 0.83 min, MS (ESipos): m/z = 472 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 3.059 (16.00), 3.287 (0.75), 3.855 (10.21), 4.263 (0.81), 4.271 (0.92), 6.785 (0.89), 6.788 (1.00), 6.806 (1.02), 6.808 (1.10), 6.923 (0.99), 6.926 (1.02), 6.942 (0.60), 7.143 (0.67), 7.149 (1.06), 7.154 (1.00), 7.171 (0.85), 7.244 (0.97), 7.265 (0.76), 7.273 (0.99), 7.294 (0.73), 7.344 (0.93), 7.349 (1.64), 7.366 (1.32), 7.370 (1.57), 7.607 (0.73), 7.625 (1.04), 7.628 (0.92), 7.646 (1.00), 7.731 (1.12), 7.735 (1.21), 7.749 (0.87), 7.752 (0.84), 8.176 (0.99), 8.180 (1.04), 8.197 (0.93), 8.201 (0.91), 8.600 (3.83), 9.082 (0.91), 9.103 (0.89).
32		LC-MS (方法 L1): Rt = 0.87 min, MS (ESipos): m/z = 490 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (1.08), 0.008 (1.10), 3.069 (16.00), 3.944 (7.95), 4.253 (0.96), 4.262 (1.04), 6.777 (1.03), 6.781 (1.18), 6.798 (1.20), 6.801 (1.26), 6.894 (0.57), 6.897 (0.59), 6.912 (1.14), 6.915 (1.14), 6.931 (0.70), 6.934 (0.68), 7.116 (0.62), 7.131 (0.71), 7.134 (0.70), 7.146 (0.75), 7.163 (0.92), 7.186 (0.84), 7.213 (0.89), 7.339 (0.92), 7.358 (0.88), 7.623 (0.67), 7.641 (1.36), 7.643 (0.86), 7.661 (1.47), 7.675 (1.33), 7.679 (1.50), 7.692 (0.67), 8.235 (1.06), 8.239 (1.07), 8.255 (1.01), 8.260 (0.92), 8.549 (4.05), 9.070 (1.00), 9.091 (0.97).
33		LC-MS (方法 L1): Rt = 0.84 min, MS (ESipos): m/z = 456 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.819 (1.63), 1.835 (1.55), 3.072 (16.00), 4.248 (0.89), 4.257 (0.93), 6.777 (0.92), 6.798 (1.00), 6.904 (0.81), 7.160 (1.13), 7.181 (0.99), 7.184 (0.91), 7.328 (0.83), 7.347 (0.76), 7.558 (0.73), 7.562 (0.79), 7.576 (1.27), 7.579 (1.20), 7.618 (1.09), 7.635 (0.76), 7.639 (1.15), 7.656 (0.69), 8.216 (1.00), 8.220 (1.05), 8.237 (0.92), 8.241 (0.89), 8.521 (3.83).
34		LC-MS (方法 L1): Rt = 0.93 min, MS (ESipos): m/z = 492 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.91), 0.008 (0.91), 3.074 (16.00), 3.287 (1.06), 4.248 (0.91), 4.255 (1.07), 6.771 (1.09), 6.774 (1.20), 6.792 (1.29), 6.795 (1.32), 6.903 (1.12), 6.922 (0.67), 7.140 (0.60), 7.156 (0.93), 7.324 (1.17), 7.328 (1.10), 7.343 (1.08), 7.347 (1.14), 7.426 (0.79), 7.437 (0.86), 7.628 (1.83), 7.632 (3.18), 7.651 (1.79), 7.669 (0.69), 7.675 (1.55), 7.679 (1.60), 7.695 (1.35), 7.699 (1.26), 8.246 (1.24), 8.259 (1.08), 8.265 (1.09), 8.520 (2.86).
35		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.12 min, MS (ESipos): m/z = 484 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (3.10), 0.008 (2.86), 1.147 (0.97), 1.920 (1.70), 1.930 (0.91), 1.940 (1.83), 1.952 (1.95), 1.961 (0.97), 1.971 (1.89), 1.993 (0.73), 2.366 (2.43), 2.525 (6.69), 2.566 (2.62), 2.710 (2.49), 2.831 (0.79), 2.852 (1.52), 2.871 (2.01), 2.891 (2.68), 2.911 (1.22), 2.963 (1.58), 2.972 (1.70), 2.985 (1.70), 2.994 (1.64), 3.002 (1.03), 3.012 (0.91), 3.024 (0.91), 3.033 (0.79), 3.288 (15.21), 3.297 (13.02), 3.859 (8.40), 3.871 (12.35), 3.882 (7.85), 5.524 (1.03), 5.543 (3.04), 5.563 (3.04), 5.582 (1.03), 7.226 (5.23), 7.234 (5.60), 7.240 (6.14), 7.248 (9.06), 7.258 (2.62), 7.270 (4.02), 7.279 (2.43), 7.292 (1.40), 7.420 (2.92), 7.429 (2.92), 7.442 (2.56), 7.451 (2.31), 7.456 (1.58), 7.466 (3.71), 7.471 (6.39), 7.476 (4.68), 7.479 (4.87), 7.497 (6.69), 7.516 (3.10), 7.538 (3.41), 7.542 (5.84), 7.547 (3.28), 7.556 (1.89), 7.560 (3.10), 7.565 (1.64), 7.640 (4.26), 7.644 (6.69), 7.649 (3.89), 7.675 (2.92), 7.693 (4.50), 7.696 (3.83), 7.714 (4.26), 7.777 (5.05), 7.781 (5.23), 7.795 (3.71), 7.799 (3.35), 8.255 (4.14), 8.258 (4.14), 8.276 (3.95), 8.279 (3.65), 8.675 (16.00), 9.020 (4.02), 9.041 (3.89).
36		LC-MS (方法 L1): Rt = 0.86 min, MS (ESipos): m/z = 472 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.70), -0.008 (6.82), 0.008 (6.40), 0.146 (0.83), 1.147 (1.53), 1.147 (4.03), 1.947 (3.76), 2.328 (1.25), 2.366 (2.09), 2.665 (1.11), 2.670 (1.25), 2.710 (2.09), 3.072 (16.00), 3.289 (10.16), 4.248 (1.11), 5.225 (0.56), 6.775 (1.11), 6.796 (1.25), 6.903 (0.83), 7.131 (1.11), 7.159 (1.11), 7.263 (0.83), 7.328 (0.97), 7.346 (0.83), 7.461 (1.25), 7.481 (0.97), 7.564 (0.97), 7.578 (1.39), 7.582 (1.39), 7.619 (1.11), 7.640 (1.25), 7.658 (0.70), 8.216 (1.11), 8.518 (4.31), 9.058 (0.56).

[1851]

37	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.90 min, MS (ESIpos): m/z = 476 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (3.91), 0.008 (3.78), 1.147 (0.96), 2.019 (0.89), 2.028 (1.03), 2.047 (0.96), 2.055 (1.51), 2.062 (1.30), 2.070 (0.89), 2.170 (0.96), 2.182 (1.30), 2.194 (1.30), 2.204 (1.17), 2.327 (0.69), 2.366 (1.44), 2.665 (0.55), 2.669 (0.76), 2.674 (0.55), 2.710 (1.51), 3.081 (16.00), 4.212 (0.69), 4.232 (2.20), 4.240 (1.85), 4.252 (3.50), 4.261 (3.64), 4.268 (2.06), 4.277 (1.99), 4.295 (0.69), 5.218 (0.89), 5.232 (1.92), 5.252 (1.85), 5.266 (0.82), 6.778 (3.50), 6.781 (3.85), 6.799 (4.05), 6.802 (4.26), 6.894 (2.06), 6.897 (2.06), 6.912 (3.98), 6.915 (3.98), 6.931 (2.61), 6.934 (2.40), 7.143 (1.99), 7.147 (2.06), 7.164 (3.09), 7.182 (1.65), 7.186 (1.58), 7.319 (1.65), 7.341 (6.59), 7.364 (4.74), 7.480 (1.51), 7.487 (2.06), 7.495 (1.72), 7.502 (2.27), 7.518 (1.72), 7.528 (1.30), 7.540 (1.30), 7.636 (2.33), 7.654 (3.71), 7.657 (2.95), 7.675 (3.57), 7.730 (3.16), 7.745 (2.06), 8.257 (2.47), 8.277 (2.33), 8.550 (5.15), 9.077 (2.61), 9.097 (2.61).
38	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.80 min, MS (ESIpos): m/z = 508 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (1.49), -0.008 (13.57), 0.008 (12.78), 0.146 (1.49), 1.147 (1.73), 2.199 (0.78), 2.327 (1.25), 2.366 (1.88), 2.669 (1.41), 2.710 (1.88), 3.043 (1.65), 3.079 (16.00), 3.287 (12.86), 3.611 (0.63), 3.906 (4.16), 3.922 (4.16), 4.249 (0.78), 5.247 (0.71), 6.777 (1.10), 6.798 (1.18), 6.911 (0.94), 7.160 (0.86), 7.355 (1.18), 7.651 (0.71), 7.669 (1.02), 7.690 (1.18), 7.752 (1.25), 8.280 (1.02), 8.302 (0.94), 8.544 (4.00).
39	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.94 min, MS (ESIpos): m/z = 526 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.97), 0.008 (0.99), 3.043 (0.70), 3.071 (16.00), 3.289 (2.25), 4.241 (0.92), 4.250 (0.99), 6.769 (1.02), 6.772 (1.12), 6.789 (1.19), 6.792 (1.24), 6.877 (0.58), 6.896 (1.12), 6.914 (0.70), 7.137 (0.61), 7.154 (0.92), 7.318 (0.87), 7.339 (1.14), 7.361 (0.68), 7.374 (0.75), 7.394 (0.75), 7.597 (1.38), 7.604 (2.28), 7.624 (1.55), 7.641 (0.61), 7.776 (0.75), 7.894 (0.85), 7.899 (0.85), 7.904 (0.85), 7.910 (0.73), 8.233 (1.09), 8.239 (1.09), 8.253 (0.97), 8.258 (0.95), 8.473 (2.47), 8.476 (2.79), 9.074 (0.75), 9.094 (0.70).
40	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.28 min, MS (ESIpos): m/z = 510 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (1.20), 0.008 (1.12), 3.036 (16.00), 3.287 (1.15), 4.256 (0.82), 4.265 (0.81), 6.785 (0.91), 6.788 (1.01), 6.805 (1.04), 6.808 (1.09), 6.923 (0.98), 6.926 (0.95), 6.942 (0.61), 7.171 (0.77), 7.355 (0.79), 7.374 (0.75), 7.674 (1.45), 7.677 (3.02), 7.681 (6.87), 7.684 (2.17), 7.687 (1.35), 7.794 (0.76), 7.801 (1.01), 7.816 (0.76), 7.823 (0.93), 7.884 (0.86), 7.882 (0.85), 7.910 (0.84), 7.917 (0.75), 8.627 (3.52), 9.120 (0.88), 9.140 (0.86).
41	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.29 min, MS (ESIpos): m/z = 528 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 3.035 (16.00), 3.287 (1.06), 4.256 (0.95), 4.266 (0.97), 6.788 (1.08), 6.808 (1.19), 6.924 (1.08), 7.173 (0.90), 7.355 (0.95), 7.374 (0.86), 7.810 (0.67), 7.817 (0.87), 7.833 (0.70), 7.840 (0.82), 7.861 (3.09), 7.878 (3.15), 7.884 (0.99), 7.891 (0.79), 7.910 (0.83), 7.917 (0.71), 8.631 (3.37), 9.121 (1.00), 9.142 (0.97).
42	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.31 min, MS (ESIpos): m/z = 552 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.084 (0.98), 2.091 (0.83), 2.207 (0.87), 2.219 (0.85), 2.229 (0.81), 3.239 (2.45), 3.250 (5.46), 3.261 (5.61), 3.272 (2.65), 3.288 (1.94), 3.860 (4.44), 3.872 (7.25), 3.883 (4.20), 4.238 (1.42), 4.245 (1.11), 4.259 (1.49), 4.266 (1.84), 4.275 (1.47), 4.281 (1.19), 4.290 (1.20), 5.250 (1.36), 5.269 (1.34), 6.787 (2.49), 6.807 (2.79), 6.913 (1.30), 6.916 (0.97), 6.932 (2.70), 6.950 (1.60), 7.154 (1.30), 7.175 (2.09), 7.193 (1.03), 7.377 (2.28), 7.395 (2.06), 7.684 (12.45), 7.686 (16.00), 7.839 (1.47), 7.843 (1.61), 7.846 (1.80), 7.861 (1.53), 7.869 (1.65), 7.892 (1.84), 7.899 (1.55), 7.917 (1.79), 7.924 (1.38), 8.694 (6.98), 9.201 (2.39), 9.221 (2.33).

[1852]

43	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.31 min, MS (ESIpos): m/z = 570 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.62), -0.008 (6.95), 0.008 (6.61), 0.146 (0.77), 1.146 (1.05), 1.235 (0.81), 2.085 (1.58), 2.208 (1.53), 2.327 (0.77), 2.366 (1.29), 2.670 (0.91), 2.709 (1.39), 3.249 (9.34), 3.260 (9.68), 3.287 (9.96), 3.861 (7.43), 3.872 (12.12), 3.883 (7.23), 4.238 (2.40), 4.266 (3.02), 4.275 (2.49), 4.292 (2.01), 5.250 (2.25), 5.269 (2.25), 6.790 (4.07), 6.808 (4.50), 6.916 (2.01), 6.932 (4.26), 6.954 (2.49), 7.159 (2.20), 7.176 (3.50), 7.197 (1.72), 7.377 (3.69), 7.396 (3.50), 7.856 (2.83), 7.863 (5.37), 7.868 (13.51), 7.884 (16.00), 7.891 (4.55), 7.898 (2.97), 7.916 (3.26), 7.923 (2.54), 8.700 (13.03), 9.202 (3.83), 9.222 (3.78).
44	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.90 min, MS (ESIpos): m/z = 472 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.21), 0.008 (2.14), 2.301 (2.93), 2.377 (7.46), 3.062 (16.00), 4.263 (0.86), 4.270 (0.99), 6.785 (1.06), 6.788 (1.15), 6.805 (1.22), 6.808 (1.26), 6.905 (0.56), 6.908 (0.59), 6.924 (1.13), 6.927 (1.11), 6.943 (0.70), 6.946 (0.67), 7.153 (0.60), 7.170 (0.91), 7.286 (1.86), 7.333 (1.69), 7.335 (1.73), 7.358 (0.93), 7.374 (0.87), 7.417 (1.07), 7.421 (1.60), 7.610 (0.86), 7.627 (1.27), 7.631 (1.03), 7.648 (1.23), 7.712 (1.31), 7.716 (1.44), 7.730 (0.99), 7.734 (0.91), 8.169 (2.71), 8.193 (1.12), 8.196 (1.15), 8.214 (1.07), 8.218 (1.00), 8.609 (4.09), 9.077 (0.98), 9.098 (0.96).
45	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.89 min, MS (ESIpos): m/z = 476 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.87), 0.008 (2.38), 3.066 (16.00), 4.242 (0.72), 4.261 (1.05), 4.269 (1.17), 6.785 (1.14), 6.788 (1.20), 6.805 (1.30), 6.808 (1.32), 6.906 (0.63), 6.909 (0.64), 6.924 (1.28), 6.928 (1.24), 6.943 (0.82), 6.946 (0.75), 7.149 (0.62), 7.153 (0.66), 7.171 (1.01), 7.352 (0.99), 7.371 (1.02), 7.477 (0.90), 7.498 (1.55), 7.521 (1.34), 7.580 (0.77), 7.586 (0.81), 7.593 (0.84), 7.598 (0.88), 7.602 (0.64), 7.607 (0.63), 7.614 (0.57), 7.622 (1.17), 7.639 (1.40), 7.643 (1.20), 7.661 (1.36), 7.754 (1.52), 7.758 (1.56), 7.772 (1.24), 7.776 (1.13), 7.788 (1.17), 7.794 (1.08), 7.807 (1.15), 7.812 (1.07), 8.205 (1.23), 8.208 (1.27), 8.226 (1.17), 8.230 (1.10), 8.278 (0.69), 8.614 (3.82), 9.077 (1.08), 9.098 (1.06).
46	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.94 min, MS (ESIpos): m/z = 476 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.83), -0.008 (7.27), 0.008 (6.79), 0.146 (0.83), 2.033 (0.69), 2.041 (0.72), 2.053 (0.69), 2.068 (1.10), 2.076 (0.89), 2.083 (0.66), 2.176 (0.69), 2.189 (0.92), 2.201 (0.92), 2.211 (0.83), 2.236 (0.60), 2.366 (0.98), 2.710 (1.04), 3.074 (16.00), 4.241 (1.55), 4.249 (1.37), 4.261 (2.38), 4.269 (2.62), 4.285 (1.40), 5.226 (0.60), 5.241 (1.40), 5.260 (1.40), 5.275 (0.63), 6.785 (2.53), 6.788 (2.68), 6.806 (2.92), 6.809 (2.95), 6.906 (1.43), 6.909 (1.46), 6.924 (2.86), 6.928 (2.74), 6.943 (1.82), 6.946 (1.67), 7.150 (1.52), 7.154 (1.49), 7.171 (2.23), 7.189 (1.16), 7.193 (1.13), 7.356 (2.32), 7.374 (2.20), 7.429 (1.13), 7.432 (1.46), 7.435 (2.47), 7.438 (2.26), 7.446 (1.31), 7.453 (2.06), 7.457 (2.41), 7.459 (2.77), 7.463 (2.86), 7.468 (1.43), 7.473 (1.61), 7.478 (1.13), 7.515 (3.04), 7.519 (4.35), 7.523 (2.26), 7.625 (0.72), 7.631 (2.68), 7.649 (2.86), 7.652 (2.59), 7.670 (2.77), 7.790 (2.95), 7.794 (3.10), 7.809 (2.47), 7.812 (2.32), 8.232 (2.15), 8.235 (2.18), 8.253 (2.06), 8.256 (1.97), 8.418 (1.28), 8.623 (3.81), 9.088 (2.12), 9.108 (2.06).
47	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.92 min, MS (ESIpos): m/z = 478 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.98), -0.011 (6.35), -0.008 (14.61), 0.008 (8.04), 0.146 (1.09), 1.147 (0.63), 2.033 (1.06), 2.041 (1.06), 2.052 (1.09), 2.068 (1.50), 2.075 (1.28), 2.083 (0.90), 2.176 (1.09), 2.189 (1.39), 2.201 (1.31), 2.211 (1.20), 2.669 (0.60), 3.079 (16.00), 4.220 (0.82), 4.240 (2.37), 4.249 (2.02), 4.260 (3.57), 4.269 (3.60), 4.275 (2.15), 4.285 (1.88), 4.304 (0.65), 5.228 (0.95), 5.240 (1.99), 5.261 (1.91), 5.275 (0.82), 6.787 (3.71), 6.790 (3.68), 6.807 (4.17), 6.810 (3.93), 6.906 (2.15), 6.909 (2.07), 6.924 (4.01), 6.928 (3.68), 6.943 (2.53), 6.947 (2.18), 7.152 (2.07), 7.156 (2.10), 7.173 (3.11), 7.190 (1.58), 7.194 (1.53), 7.352 (3.08), 7.371 (3.03), 7.558 (4.31), 7.575 (4.63), 7.581 (5.34), 7.589 (4.61), 7.608 (0.93), 7.632 (2.81), 7.650 (3.84), 7.653 (3.35), 7.671 (3.43), 7.791 (4.03), 7.795 (4.09), 7.809 (3.35), 7.813 (2.94), 8.233 (2.78), 8.254 (2.40), 8.444 (1.55), 8.617 (4.03), 9.093 (2.64), 9.113 (2.53).

[1853]

48	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.98 min; MS (ESIpos): m/z = 526 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (1.64), -0.008 (16.00), 0.008 (12.95), 0.146 (1.58), 1.147 (1.58), 2.025 (1.87), 2.033 (2.09), 2.045 (2.32), 2.060 (3.17), 2.068 (2.71), 2.169 (2.04), 2.181 (2.94), 2.195 (2.83), 2.203 (2.83), 2.217 (1.87), 2.327 (1.02), 2.366 (2.15), 2.669 (1.30), 2.709 (2.20), 3.193 (6.61), 4.195 (1.58), 4.216 (4.24), 4.237 (3.56), 4.253 (3.34), 4.262 (4.35), 4.269 (3.79), 4.278 (3.96), 4.289 (1.70), 4.297 (1.92), 5.198 (1.70), 5.212 (3.84), 5.232 (3.84), 6.786 (7.41), 6.789 (7.75), 6.807 (8.54), 6.810 (8.59), 6.888 (4.13), 6.891 (4.18), 6.907 (8.65), 6.910 (8.37), 6.925 (5.37), 6.928 (4.98), 7.149 (4.18), 7.153 (4.35), 7.171 (6.78), 7.188 (3.34), 7.192 (3.39), 7.341 (7.24), 7.360 (6.90), 7.446 (3.39), 7.466 (2.77), 7.516 (4.01), 7.681 (4.47), 7.699 (5.88), 7.720 (4.01), 7.798 (2.94), 8.345 (2.37), 8.479 (3.11), 9.124 (3.00), 9.144 (3.05).
49	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.86 min; MS (ESIpos): m/z = 460 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (1.77), -0.008 (16.00), 0.008 (13.79), 0.146 (1.77), 1.147 (1.47), 2.040 (1.77), 2.067 (2.73), 2.073 (2.21), 2.189 (2.43), 2.201 (2.36), 2.211 (2.29), 2.327 (1.40), 2.366 (2.73), 2.669 (1.40), 2.710 (2.65), 3.179 (6.34), 4.207 (1.25), 4.228 (3.47), 4.249 (3.02), 4.259 (3.32), 4.270 (3.61), 4.276 (3.02), 4.286 (3.10), 4.304 (1.33), 5.225 (3.17), 5.245 (3.10), 6.420 (0.59), 6.443 (0.59), 6.792 (6.34), 6.795 (6.64), 6.813 (7.37), 6.816 (7.30), 6.900 (3.39), 6.903 (3.47), 6.918 (6.93), 6.922 (6.78), 6.937 (4.50), 6.940 (4.35), 7.156 (3.54), 7.160 (3.61), 7.178 (5.46), 7.195 (3.24), 7.199 (2.80), 7.217 (0.66), 7.241 (1.11), 7.265 (0.74), 7.319 (9.07), 7.324 (9.73), 7.345 (12.90), 7.366 (6.05), 7.377 (1.84), 7.382 (1.92), 7.398 (1.62), 7.404 (1.33), 7.653 (3.10), 7.671 (4.87), 7.692 (3.76), 7.820 (4.87), 7.836 (3.98), 8.132 (1.25), 8.280 (2.36), 8.538 (1.62), 9.132 (2.51).
50	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.96 min; MS (ESIpos): m/z = 510 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (1.73), -0.008 (16.00), 0.008 (14.73), 0.146 (1.80), 1.147 (1.73), 2.033 (2.47), 2.045 (2.87), 2.060 (3.80), 2.075 (2.47), 2.167 (2.47), 2.180 (3.53), 2.192 (3.47), 2.201 (3.33), 2.214 (2.40), 2.327 (1.33), 2.366 (2.40), 2.669 (1.53), 2.710 (2.40), 3.162 (9.07), 4.196 (1.80), 4.217 (5.20), 4.238 (4.73), 4.250 (4.93), 4.260 (5.33), 4.267 (4.60), 4.275 (4.67), 4.295 (2.07), 5.197 (2.00), 5.213 (4.67), 5.232 (4.67), 5.245 (2.20), 6.784 (9.40), 6.786 (10.33), 6.804 (10.73), 6.807 (11.13), 6.887 (5.20), 6.890 (5.40), 6.906 (10.73), 6.909 (10.67), 6.924 (6.47), 6.928 (6.20), 7.147 (5.13), 7.151 (5.33), 7.168 (8.33), 7.185 (4.13), 7.189 (4.07), 7.347 (8.87), 7.363 (8.33), 7.540 (4.60), 7.680 (3.40), 7.698 (6.33), 7.719 (4.87), 7.790 (8.33), 7.878 (3.47), 8.132 (1.13), 8.342 (3.00), 8.498 (4.40), 9.120 (3.87), 9.138 (3.87).
51	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.89 min; MS (ESIpos): m/z = 476 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (1.69), -0.008 (16.00), 0.008 (14.14), 0.146 (1.86), 1.147 (1.52), 2.032 (1.78), 2.060 (2.62), 2.183 (2.37), 2.196 (2.29), 2.205 (2.20), 2.218 (1.61), 2.328 (1.27), 2.332 (1.02), 2.366 (2.88), 2.670 (1.44), 2.710 (3.05), 3.203 (4.99), 4.196 (1.27), 4.217 (3.30), 4.237 (2.88), 4.263 (3.56), 4.271 (3.05), 4.280 (3.13), 5.211 (3.13), 5.231 (3.13), 6.787 (6.26), 6.790 (6.52), 6.808 (7.20), 6.811 (7.11), 6.889 (3.64), 6.892 (3.64), 6.908 (7.53), 6.911 (6.94), 6.927 (4.49), 6.930 (4.23), 7.151 (3.56), 7.155 (3.56), 7.172 (5.59), 7.189 (2.79), 7.193 (2.96), 7.346 (7.28), 7.364 (8.30), 7.436 (3.30), 7.697 (5.67), 7.718 (4.06), 7.778 (2.46), 8.132 (1.69), 8.336 (1.86), 8.478 (2.12), 9.127 (2.37).

[1854]

52	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.17 min; MS (ESIpos): m/z = 534 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.150 (0.80), -0.008 (7.08), 0.008 (6.23), 0.146 (0.85), 1.147 (0.94), 1.234 (1.04), 1.401 (0.66), 2.061 (1.98), 2.184 (1.46), 2.196 (1.94), 2.208 (1.84), 2.218 (1.84), 2.327 (0.66), 2.366 (1.32), 2.669 (0.76), 2.710 (1.37), 3.288 (16.00), 3.336 (2.41), 3.866 (9.35), 3.876 (15.01), 3.888 (8.54), 4.211 (1.09), 4.231 (3.26), 4.239 (2.55), 4.252 (4.48), 4.262 (4.25), 4.270 (2.78), 4.279 (2.83), 4.298 (0.94), 5.241 (2.45), 5.256 (2.41), 5.754 (5.00), 6.777 (5.57), 6.794 (5.95), 6.797 (6.14), 6.893 (2.17), 6.912 (4.63), 6.930 (2.69), 7.140 (2.64), 7.161 (4.58), 7.178 (2.08), 7.304 (1.84), 7.307 (1.98), 7.323 (2.88), 7.327 (3.59), 7.333 (2.45), 7.352 (7.69), 7.370 (4.44), 7.413 (2.17), 7.424 (2.55), 7.432 (3.73), 7.444 (4.11), 7.451 (2.08), 7.463 (2.03), 7.655 (2.12), 7.659 (2.93), 7.672 (7.74), 7.677 (7.17), 7.684 (14.35), 7.687 (8.73), 7.704 (12.93), 7.707 (7.46), 7.722 (3.26), 8.277 (5.38), 8.282 (5.47), 8.297 (4.91), 8.302 (4.67), 8.583 (8.50), 8.590 (9.39), 9.143 (2.27), 9.158 (3.16), 9.178 (2.55).
53	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.02 min; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.011 (3.43), -0.008 (7.74), 0.008 (4.34), 0.146 (0.57), 1.157 (2.48), 1.175 (4.93), 1.193 (2.43), 1.988 (8.75), 2.057 (0.67), 2.072 (0.90), 2.080 (0.75), 2.204 (0.82), 2.216 (0.77), 2.225 (0.77), 3.272 (2.97), 3.285 (6.13), 3.297 (8.04), 3.863 (4.09), 3.875 (6.63), 3.887 (3.55), 3.945 (16.00), 4.003 (0.72), 4.021 (2.03), 4.038 (2.03), 4.056 (0.67), 4.236 (1.36), 4.244 (1.09), 4.257 (1.56), 4.270 (1.44), 4.277 (1.09), 4.286 (1.09), 5.269 (1.24), 5.269 (1.16), 6.780 (2.31), 6.783 (2.38), 6.800 (2.55), 6.803 (2.50), 6.902 (1.27), 6.906 (1.27), 6.921 (2.43), 6.924 (2.23), 6.940 (1.54), 6.943 (1.36), 7.100 (0.70), 7.115 (1.01), 7.121 (1.41), 7.128 (0.80), 7.137 (1.63), 7.140 (1.61), 7.146 (1.99), 7.151 (1.98), 7.156 (1.37), 7.166 (2.21), 7.168 (2.40), 7.186 (1.12), 7.190 (1.14), 7.195 (1.44), 7.199 (1.34), 7.216 (1.04), 7.221 (2.01), 7.226 (1.29), 7.243 (0.85), 7.247 (0.80), 7.353 (0.64), 7.356 (0.82), 7.361 (2.01), 7.374 (1.09), 7.377 (1.11), 7.381 (1.86), 7.381 (0.57), 7.465 (0.90), 7.485 (0.60), 7.676 (1.27), 7.694 (3.10), 7.714 (4.29), 7.717 (3.84), 7.722 (3.60), 7.734 (1.24), 7.739 (0.70), 8.095 (0.60), 8.278 (2.26), 8.283 (2.09), 8.298 (2.13), 8.303 (1.81), 8.615 (10.00), 9.154 (2.23), 9.175 (2.11).
54	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.24 min; MS (ESIpos): m/z = 552 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (1.29), -0.008 (12.61), 0.008 (10.72), 0.146 (1.29), 1.147 (0.91), 1.235 (0.73), 1.988 (0.80), 2.087 (1.68), 2.210 (1.47), 2.231 (1.33), 2.366 (1.33), 2.710 (1.40), 3.267 (4.16), 3.278 (9.96), 3.287 (15.97), 3.864 (7.30), 3.876 (12.16), 3.888 (7.06), 4.224 (0.73), 4.244 (2.38), 4.252 (1.92), 4.265 (3.14), 4.276 (3.00), 4.292 (2.06), 5.255 (2.20), 5.275 (2.24), 6.789 (4.37), 6.810 (4.72), 6.916 (1.99), 6.919 (2.06), 6.934 (4.26), 6.953 (2.59), 7.154 (2.24), 7.158 (2.17), 7.175 (3.49), 7.192 (1.71), 7.381 (3.70), 7.399 (3.42), 7.681 (3.00), 7.689 (4.19), 7.702 (3.95), 7.720 (3.84), 7.806 (14.46), 7.822 (14.43), 7.843 (4.61), 7.846 (4.93), 7.861 (3.77), 7.864 (3.67), 8.273 (3.95), 8.277 (4.12), 8.295 (3.81), 8.298 (3.67), 8.704 (16.00), 9.165 (3.98), 9.186 (3.91).
55	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.44 min; MS (ESIpos): m/z = 472 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.58), 0.008 (1.48), 3.056 (16.00), 3.065 (1.61), 3.289 (1.47), 3.903 (10.43), 3.909 (1.22), 4.271 (0.85), 6.785 (0.92), 6.788 (1.00), 6.805 (1.06), 6.808 (1.08), 6.926 (1.03), 6.929 (0.97), 6.945 (0.63), 7.171 (0.82), 7.220 (0.62), 7.242 (1.22), 7.264 (0.82), 7.354 (0.82), 7.374 (1.35), 7.376 (1.39), 7.382 (0.75), 7.475 (0.94), 7.480 (0.83), 7.507 (0.90), 7.513 (0.86), 7.597 (0.76), 7.615 (1.05), 7.618 (0.89), 7.636 (1.04), 7.717 (1.17), 7.721 (1.25), 7.735 (0.90), 7.739 (0.84), 8.156 (1.01), 8.160 (1.04), 8.177 (0.96), 8.181 (0.89), 8.608 (4.20), 9.075 (0.90), 9.096 (0.86).
56	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.79 min; MS (ESIpos): m/z = 472 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.403 (6.76), 3.060 (16.00), 3.164 (0.79), 3.174 (0.80), 4.261 (0.74), 6.787 (0.91), 6.789 (0.97), 6.803 (1.01), 6.806 (1.01), 6.925 (0.96), 6.927 (0.92), 6.940 (0.58), 7.170 (0.76), 7.355 (0.76), 7.370 (0.74), 7.431 (1.71), 7.447 (1.38), 7.451 (1.32), 7.614 (0.78), 7.629 (1.13), 7.631 (1.04), 7.636 (1.77), 7.639 (1.64), 7.646 (1.03), 7.721 (1.15), 7.724 (1.19), 7.735 (0.90), 7.738 (0.83), 8.185 (1.00), 8.188 (1.01), 8.202 (0.95), 8.205 (0.87), 8.601 (3.95), 9.077 (0.87), 9.094 (0.83).

[1855]

57	2.11	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.92 min; MS (ESIpos): m/z = 478 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 3.070 (16.00), 6.781 (0.93), 6.783 (1.06), 6.797 (1.06), 6.799 (1.13), 6.915 (0.96), 6.917 (1.03), 6.932 (0.60), 7.165 (0.83), 7.344 (0.66), 7.358 (0.80), 7.637 (0.80), 7.652 (1.06), 7.654 (0.90), 7.669 (1.03), 7.716 (1.03), 7.718 (1.16), 7.730 (0.77), 7.732 (0.77), 8.251 (0.96), 8.254 (1.06), 8.268 (0.93), 8.271 (0.93), 8.559 (3.79), 9.074 (0.90), 9.090 (0.86).
58	2.11	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.42 min; MS (ESIpos): m/z = 568 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (399.9532 MHz, DMSO): δ = 8.8706 (0.51); 8.8451 (2.08); 8.4185 (0.68); 8.4155 (0.71); 8.3974 (0.66); 8.3942 (0.64); 8.3138 (0.34); 7.984 (0.62); 7.7955 (0.67); 7.7805 (0.77); 7.7776 (0.75); 7.664 (3.27); 7.6592 (3.77); 7.602 (0.98); 7.5971 (1.58); 7.5922 (0.8); 7.5884 (0.66); 7.5699 (0.62); 7.5674 (0.69); 7.5491 (0.53); 7.2426 (0.53); 7.2249 (0.57); 7.1558 (0.53); 7.1387 (0.34); 6.8988 (0.39); 6.896 (0.43); 6.8801 (0.66); 6.8773 (0.7); 6.8616 (0.34); 6.8587 (0.35); 6.806 (0.78); 6.8035 (0.77); 6.7657 (0.73); 6.7829 (0.66); 5.3292 (0.33); 4.3233 (0.33); 4.2445 (0.35); 3.315 (36.45); 2.6749 (0.48); 2.6702 (0.67); 2.6656 (0.48); 2.5236 (1.77); 2.5187 (2.78); 2.5102 (37.2); 2.5056 (77.48); 2.501 (107.64); 2.4965 (79.14); 2.492 (37.03); 2.3325 (0.44); 2.3279 (0.63); 2.3234 (0.47); 1.9882 (0.43); 1.398 (16); 0.008 (1.74); -0.0001 (52.5); -0.0065 (1.57).
59		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.42 min; MS (ESIpos): m/z = 568 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (3.35), 0.008 (3.16), 2.093 (0.79), 2.366 (0.71), 2.710 (0.67), 2.925 (16.00), 3.287 (2.93), 4.247 (1.14), 4.254 (1.00), 4.266 (1.71), 4.274 (1.91), 4.289 (1.02), 4.422 (6.70), 5.298 (1.04), 5.319 (1.04), 6.784 (2.02), 6.787 (2.18), 6.804 (2.31), 6.807 (2.37), 6.889 (1.10), 6.893 (1.06), 6.908 (2.16), 6.911 (2.08), 6.927 (1.37), 6.930 (1.31), 7.145 (1.10), 7.150 (1.10), 7.167 (1.66), 7.184 (0.83), 7.188 (0.85), 7.302 (0.69), 7.319 (1.89), 7.333 (0.81), 7.337 (1.46), 7.341 (0.81), 7.389 (2.00), 7.405 (3.56), 7.408 (5.68), 7.421 (2.41), 7.427 (4.85), 7.444 (4.93), 7.461 (2.10), 7.465 (1.46), 7.642 (1.14), 7.646 (2.04), 7.647 (2.98), 7.651 (5.53), 7.656 (14.31), 7.660 (4.91), 7.690 (1.73), 7.708 (2.27), 7.711 (1.98), 7.729 (2.16), 7.835 (2.54), 7.838 (2.66), 7.853 (2.02), 7.857 (1.91), 8.318 (2.18), 8.321 (2.23), 8.339 (2.06), 8.343 (1.85), 8.752 (9.09), 9.153 (2.02), 9.174 (1.98).
60		LC-MS (方法 L1): Rt = 0.85 min; MS (ESIpos): m/z = 476 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.988 (0.48), 2.044 (0.43), 2.085 (0.43), 3.066 (2.26), 3.075 (16.00), 3.169 (2.25), 4.230 (0.60), 4.249 (0.92), 4.257 (1.04), 4.271 (0.62), 5.227 (0.50), 5.244 (0.54), 6.775 (1.07), 6.793 (1.18), 6.884 (0.51), 6.903 (1.06), 6.922 (0.68), 7.141 (0.56), 7.158 (0.91), 7.175 (0.50), 7.214 (0.55), 7.331 (0.84), 7.351 (0.82), 7.438 (1.23), 7.449 (1.52), 7.460 (1.03), 7.467 (1.28), 7.625 (0.51), 7.638 (2.53), 7.642 (1.75), 7.657 (1.45), 7.674 (0.45), 8.228 (0.46), 8.248 (0.96), 8.254 (0.96), 8.266 (0.84), 8.273 (0.82), 8.522 (3.66), 9.072 (0.54), 9.091 (0.52).
61		LC-MS (方法 L6): Rt = 1.62 min; MS (ESIpos): m/z = 456 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (4.15), 0.008 (3.77), 2.366 (1.07), 2.386 (6.43), 2.710 (1.00), 3.060 (16.00), 3.287 (5.91), 3.681 (0.59), 4.270 (0.79), 6.787 (0.97), 6.805 (1.00), 6.808 (1.04), 6.923 (0.93), 6.942 (0.66), 7.187 (0.86), 7.221 (1.56), 7.355 (0.76), 7.372 (0.76), 7.608 (0.76), 7.626 (1.07), 7.629 (0.93), 7.647 (1.04), 7.717 (1.14), 7.720 (1.21), 7.734 (0.90), 7.738 (0.79), 8.188 (1.00), 8.192 (1.04), 8.210 (0.93), 8.214 (0.90), 8.606 (3.97), 9.077 (0.83), 9.097 (0.79).
62		LC-MS (方法 L6): Rt = 1.27 min; MS (ESIpos): m/z = 443 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, 二氯甲烷 -d2) δ [ppm]: 3.078 (16.00), 4.203 (0.84), 5.308 (0.97), 5.320 (1.31), 5.341 (0.74), 5.356 (0.72), 6.815 (1.16), 6.831 (1.27), 6.913 (1.20), 6.927 (0.69), 7.165 (0.71), 7.179 (1.10), 7.297 (0.77), 7.305 (0.99), 7.315 (1.75), 7.331 (1.10), 7.446 (0.67), 7.463 (1.09), 7.554 (0.91), 7.569 (1.18), 7.571 (1.18), 7.586 (0.87), 7.726 (1.17), 7.728 (1.20), 7.740 (1.02), 7.741 (1.01), 8.152 (1.65), 8.166 (1.87), 8.673 (2.52).

[1856]

63	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.57 min; MS (ESIpos): m/z = 443 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.362 (0.64), 2.635 (0.64), 3.075 (16.00), 6.787 (0.94), 6.790 (1.04), 6.804 (1.04), 6.806 (1.09), 6.925 (0.94), 6.927 (0.99), 6.942 (0.99), 7.171 (0.79), 7.355 (0.84), 7.369 (0.79), 7.422 (1.78), 7.603 (0.74), 7.612 (0.79), 7.670 (0.79), 7.684 (0.99), 7.687 (0.99), 7.702 (0.89), 7.857 (1.04), 7.859 (1.19), 7.871 (0.99), 7.873 (1.04), 8.279 (0.99), 8.282 (1.09), 8.296 (0.99), 8.301 (1.88), 8.311 (1.39), 8.626 (3.76), 9.094 (0.84), 9.110 (0.84).
64	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.48 min; MS (ESIpos): m/z = 455 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.17), 3.065 (16.00), 3.909 (9.18), 4.260 (0.93), 4.268 (0.99), 5.752 (2.29), 6.786 (1.02), 6.803 (1.15), 6.806 (1.15), 6.923 (1.06), 6.941 (0.64), 7.014 (1.90), 7.016 (2.04), 7.169 (0.88), 7.194 (1.22), 7.197 (1.12), 7.207 (1.15), 7.210 (1.10), 7.349 (0.91), 7.368 (0.83), 7.632 (0.74), 7.650 (1.07), 7.653 (0.90), 7.671 (0.98), 7.768 (1.17), 7.772 (1.15), 7.785 (0.90), 7.789 (0.83), 8.205 (1.69), 8.218 (1.63), 8.232 (1.04), 8.236 (1.05), 8.254 (0.98), 8.257 (0.90), 8.602 (3.69), 9.076 (0.93), 9.097 (0.90).
65	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.69 min; MS (ESIpos): m/z = 459 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.362 (0.80), 2.635 (0.74), 3.074 (16.00), 4.264 (0.74), 6.790 (1.04), 6.804 (1.04), 6.806 (1.16), 6.926 (0.98), 6.928 (1.04), 6.941 (0.55), 7.173 (0.80), 7.358 (0.86), 7.372 (0.80), 7.654 (1.04), 7.657 (1.16), 7.667 (1.66), 7.680 (0.98), 7.683 (0.98), 7.697 (0.92), 7.752 (1.90), 7.753 (1.96), 7.849 (1.04), 7.852 (1.16), 7.864 (0.98), 7.866 (0.98), 8.277 (0.98), 8.280 (1.10), 8.294 (0.92), 8.297 (0.98), 8.479 (1.53), 8.489 (1.53), 8.630 (3.74), 9.093 (0.92), 9.109 (0.92).
66	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.08 min; MS (ESIpos): m/z = 453 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.007 (3.16), 0.007 (2.43), 2.085 (0.91), 2.479 (16.00), 3.063 (15.53), 3.290 (1.71), 4.259 (0.73), 5.753 (4.07), 6.787 (0.96), 6.789 (1.08), 6.805 (1.15), 6.923 (1.01), 6.925 (1.05), 6.938 (0.58), 6.940 (0.59), 7.170 (0.86), 7.229 (4.94), 7.355 (0.90), 7.369 (0.82), 7.626 (0.70), 7.640 (1.04), 7.643 (0.94), 7.657 (0.96), 7.718 (1.11), 7.721 (1.23), 7.732 (0.83), 7.735 (0.84), 8.141 (0.84), 8.219 (0.97), 8.222 (1.05), 8.236 (0.90), 8.239 (0.91), 8.601 (3.53), 9.079 (0.94), 9.095 (0.92).
67	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.42 min; MS (ESIpos): m/z = 520 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.73), 0.008 (1.62), 1.083 (7.08), 1.101 (16.00), 1.119 (7.35), 2.523 (1.15), 3.360 (2.01), 3.378 (5.98), 3.395 (5.74), 3.413 (1.81), 4.238 (1.03), 4.246 (0.84), 4.259 (1.48), 4.269 (1.39), 4.277 (0.92), 4.286 (0.88), 5.239 (0.96), 5.259 (0.94), 6.786 (1.61), 6.789 (1.77), 6.807 (1.84), 6.809 (1.93), 6.913 (0.87), 6.916 (0.88), 6.931 (1.76), 6.934 (1.80), 6.950 (1.09), 6.953 (1.08), 7.152 (0.90), 7.156 (0.98), 7.174 (1.49), 7.191 (0.74), 7.195 (0.72), 7.362 (1.54), 7.378 (1.43), 7.628 (0.85), 7.634 (2.10), 7.638 (4.21), 7.644 (9.24), 7.649 (4.32), 7.657 (2.01), 7.660 (1.75), 7.678 (1.75), 7.797 (1.98), 7.800 (2.12), 7.815.
68	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.36 min; MS (ESIpos): m/z = 583 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.845 (0.84), 2.040 (0.83), 2.050 (0.89), 2.057 (0.88), 2.068 (0.71), 4.052 (0.72), 4.064 (0.80), 4.069 (1.50), 4.075 (0.94), 4.087 (0.97), 4.092 (0.74), 4.167 (0.77), 4.172 (0.97), 4.180 (0.89), 4.187 (1.11), 5.072 (1.29), 5.088 (1.26), 5.753 (0.58), 6.752 (4.3), 6.754 (2.55), 6.768 (2.63), 6.771 (2.67), 6.844 (1.23), 6.846 (1.20), 6.859 (2.46), 6.861 (2.43), 6.874 (1.49), 6.876 (1.41), 7.009 (2.20), 7.082 (1.84), 7.134 (1.29), 7.138 (1.18), 7.151 (2.04), 7.165 (1.14), 7.168 (0.92), 7.593 (2.44), 7.595 (2.47), 7.610 (2.69), 7.612 (2.56), 7.680 (0.95), 7.709 (1.44), 7.711 (2.27), 7.713 (4.04), 7.716 (8.15), 7.718 (16.00), 7.721 (5.44), 7.831 (2.20), 7.845 (2.64), 7.848 (2.23), 7.863 (2.06), 8.037 (2.79), 8.039 (2.83), 8.051 (2.40), 8.054 (2.29), 8.418 (6.05), 8.870 (4.59), 8.961 (0.63), 9.079 (2.41), 9.095 (2.29), 9.192 (9.46).

[1857]

69	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.86 min, MS (ESipos): m/z = 514 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (4.56), 0.008 (2.59), 1.234 (0.95), 1.880 (1.58), 1.890 (0.87), 1.901 (1.75), 1.912 (1.84), 1.923 (0.87), 1.933 (1.74), 2.350 (0.80), 2.361 (1.45), 2.369 (1.79), 2.381 (1.55), 2.392 (1.49), 2.401 (1.25), 2.775 (0.78), 2.797 (1.46), 2.816 (1.81), 2.837 (2.31), 2.858 (1.06), 2.937 (1.44), 2.945 (1.55), 2.959 (1.61), 2.966 (1.48), 2.976 (1.06), 2.985 (0.97), 2.998 (0.95), 3.005 (0.79), 5.345 (0.97), 5.365 (2.65), 5.384 (2.58), 5.405 (0.85), 5.754 (15.35), 7.164 (0.99), 7.162 (3.03), 7.195 (4.52), 7.200 (5.02), 7.215 (3.94), 7.230 (2.07), 7.247 (4.63), 7.264 (2.00), 7.277 (3.90), 7.293 (2.68), 7.402 (2.41), 7.420 (3.40), 7.441 (2.65), 7.539 (4.31), 7.610 (2.91), 7.615 (5.39), 7.620 (4.00), 7.646 (16.00), 7.651 (11.73), 7.738 (4.35), 7.756 (3.85), 8.133 (12.50), 8.155 (3.28), 8.795 (9.42), 8.838 (3.65), 8.858 (3.47), 9.979 (4.48), 12.732 (2.72).
70	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.42 min, MS (ESineg): m/z = 465 [M-H] ⁻	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.912 (16.00), 3.056 (8.85), 3.304 (1.27), 5.751 (0.73), 6.786 (0.85), 6.788 (0.88), 6.802 (0.93), 6.805 (0.92), 6.832 (0.77), 6.848 (0.83), 6.883 (0.92), 6.887 (1.01), 6.888 (1.00), 6.921 (0.87), 6.923 (0.83), 7.219 (0.72), 7.235 (1.00), 7.251 (0.60), 7.591 (0.61), 7.605 (0.91), 7.608 (0.71), 7.622 (0.84), 7.675 (0.96), 7.678 (0.97), 7.689 (0.69), 8.132 (0.85), 8.150 (0.79), 8.153 (0.78), 8.168 (0.74), 8.567 (2.33), 9.079 (0.74).
71	LC-MS (方法 L6): Rt = 0.97 min, MS (ESineg): m/z = 476 [M-H] ⁻	¹ H-NMR (500 MHz, 氯仿 -d) δ [ppm]: 3.144 (16.00), 3.851 (8.34), 4.212 (0.71), 6.859 (1.08), 6.861 (1.16), 6.875 (1.18), 6.877 (1.26), 6.908 (0.59), 6.910 (0.57), 6.923 (1.17), 6.925 (1.11), 6.938 (0.69), 6.940 (0.64), 7.204 (0.94), 7.302 (0.98), 7.318 (0.92), 7.590 (0.88), 7.604 (1.17), 7.607 (1.08), 7.621 (1.12), 7.653 (1.78), 7.757 (1.31), 7.760 (1.38), 7.772 (1.15), 7.774 (1.07), 7.886 (0.77), 8.127 (1.09), 8.130 (1.10), 8.144 (1.04), 8.147 (0.99), 9.040 (1.35).
72	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.34 min, MS (ESipos): m/z = 515 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.934 (0.65), 0.951 (1.40), 0.969 (0.72), 1.815 (0.91), 1.825 (1.04), 1.842 (1.24), 1.859 (0.77), 2.014 (1.18), 2.027 (1.17), 2.035 (1.12), 2.049 (0.88), 2.694 (1.05), 4.031 (0.92), 4.052 (1.96), 4.059 (1.36), 4.073 (1.35), 4.080 (1.05), 4.158 (1.43), 4.168 (1.30), 4.176 (1.62), 4.186 (0.92), 4.196 (0.91), 5.044 (0.78), 5.058 (1.79), 5.077 (1.81), 5.092 (0.82), 6.686 (3.38), 6.691 (5.17), 6.696 (3.37), 6.736 (3.20), 6.754 (3.60), 6.845 (1.55), 6.864 (3.34), 6.883 (2.11), 7.082 (3.20), 7.102 (2.64), 7.117 (1.82), 7.122 (1.57), 7.138 (2.83), 7.156 (1.43), 7.665 (2.79), 7.668 (2.76), 7.686 (3.87), 7.689 (3.76), 7.710 (16.00), 7.714 (7.25), 7.776 (2.70), 7.794 (3.62), 7.815 (2.25), 7.938 (5.43), 7.942 (5.37), 7.987 (3.52), 7.990 (3.35), 8.005 (3.05), 8.008 (2.74), 8.147 (5.19), 8.153 (5.21), 8.914 (3.01), 8.935 (2.93), 9.116 (10.01).
73	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.71 min, MS (ESipos): m/z = 463 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.06), 0.008 (1.57), 2.133 (0.74), 2.366 (0.70), 2.524 (2.87), 2.710 (0.70), 3.079 (16.00), 4.252 (0.87), 4.260 (0.94), 5.753 (3.02), 5.955 (1.19), 6.777 (1.02), 6.794 (1.11), 6.881 (0.59), 6.900 (1.22), 6.902 (1.13), 6.918 (0.70), 7.029 (0.98), 7.031 (1.06), 7.047 (1.44), 7.135 (1.44), 7.156 (2.13), 7.174 (1.26), 7.248 (1.09), 7.254 (1.43), 7.262 (1.04), 7.308 (1.02), 7.322 (0.96), 7.342 (0.81), 7.404 (1.37), 7.424 (1.15), 7.629 (0.83), 7.647 (1.07), 7.650 (0.89), 7.668 (1.04), 7.733 (1.26), 7.737 (1.35), 7.751 (0.94), 7.754 (0.87), 8.192 (1.00), 8.196 (1.04), 8.214 (0.98), 8.217 (0.87), 8.469 (3.80), 9.059 (0.93), 9.080 (0.89), 11.099 (0.85).
74	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.42 min, MS (ESipos): m/z = 508 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 3.169 (16.00), 3.645 (1.14), 3.658 (1.38), 6.762 (0.83), 6.799 (0.91), 6.803 (0.87), 6.899 (0.86), 7.602 (1.31), 7.607 (1.19), 7.622 (4.81), 7.627 (2.96), 8.133 (2.91), 8.546 (2.19).

[1858]

75	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.54 min; MS (ESIpos): m/z = 536 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.97), 0.008 (0.95), 2.085 (1.49), 3.061 (10.00), 3.173 (16.00), 3.455 (2.24), 3.469 (1.54), 3.554 (0.89), 3.567 (1.31), 3.585 (1.41), 6.788 (1.20), 6.791 (1.37), 6.809 (1.39), 6.812 (1.48), 6.926 (1.31), 6.929 (1.31), 6.944 (0.78), 6.947 (0.77), 7.174 (1.05), 7.357 (1.04), 7.372 (1.00), 7.637 (2.10), 7.641 (10.04), 7.645 (3.82), 7.663 (1.38), 7.667 (1.27), 7.685 (1.30), 7.805 (1.45), 7.809 (1.59), 7.823 (1.19), 7.827 (1.19), 8.299 (1.28), 8.303 (1.36), 8.320 (1.23), 8.324 (1.19), 8.712 (5.32), 9.065 (1.22), 9.086 (1.19).
76	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.92 min; MS (ESIpos): m/z = 522 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.51), 0.008 (2.41), 2.063 (1.06), 2.073 (1.60), 2.143 (0.95), 2.157 (1.15), 2.327 (0.87), 2.523 (2.45), 2.670 (0.84), 3.334 (4.14), 3.356 (4.85), 3.567 (2.37), 3.581 (5.84), 3.593 (3.89), 3.684 (3.13), 3.697 (2.74), 4.269 (3.13), 4.278 (2.53), 4.286 (1.74), 5.247 (1.52), 5.266 (1.51), 6.783 (2.84), 6.786 (3.12), 6.804 (3.25), 6.807 (3.39), 6.884 (1.49), 6.887 (1.55), 6.903 (3.11), 6.906 (3.03), 6.921 (1.86), 6.924 (1.77), 7.143 (1.48), 7.148 (1.63), 7.165 (2.50), 7.182 (1.18), 7.186 (1.20), 7.294 (2.53), 7.314 (2.37), 7.531 (1.18), 7.551 (1.97), 7.569 (1.32), 7.609 (3.49), 7.614 (3.76), 7.624 (16.00), 7.628 (9.17), 7.750 (2.78), 7.766 (2.37), 8.381 (1.85), 8.402 (1.76), 8.568 (5.29), 9.023 (1.39), 9.042 (1.36).
77	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.88 min; MS (ESIpos): m/z = 533 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.063 (0.91), 3.712 (0.91), 4.023 (3.89), 4.028 (3.96), 4.242 (1.32), 4.251 (1.33), 4.261 (1.86), 4.270 (2.06), 4.282 (1.19), 4.674 (1.12), 4.887 (1.03), 4.916 (1.04), 4.929 (2.17), 4.947 (2.17), 4.961 (1.00), 5.241 (1.16), 5.261 (1.09), 5.754 (5.20), 6.794 (2.03), 6.814 (2.13), 6.905 (0.96), 6.907 (1.01), 6.923 (1.92), 6.926 (1.96), 6.942 (1.13), 6.945 (1.13), 7.156 (1.19), 7.160 (1.25), 7.177 (1.78), 7.195 (0.88), 7.199 (0.81), 7.327 (1.71), 7.346 (1.58), 7.626 (1.09), 7.630 (1.31), 7.640 (16.00), 7.647 (1.70), 7.659 (2.46), 7.664 (2.09), 7.681 (1.56), 7.839 (1.82), 7.842 (2.20), 7.857 (1.59), 7.860 (1.81), 8.138 (2.43), 8.305 (1.86), 8.309 (2.07), 8.327 (1.68), 8.330 (1.74), 8.711 (2.71), 8.734 (6.72), 8.846 (0.69), 9.226 (1.85), 9.246 (1.78).
78	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.41 min; MS (ESIpos): m/z = 580 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.356 (0.92), 3.007 (16.00), 3.407 (0.85), 3.421 (1.08), 3.473 (1.23), 3.486 (0.97), 3.552 (1.13), 3.559 (1.40), 3.565 (1.84), 3.573 (1.77), 5.754 (2.61), 6.794 (0.83), 6.813 (0.96), 6.927 (0.88), 7.329 (0.75), 7.638 (0.93), 7.643 (1.08), 7.652 (3.47), 7.657 (2.11), 7.666 (0.89), 7.687 (0.67), 7.810 (0.96), 7.827 (0.77), 8.237 (0.79), 8.240 (0.79), 8.258 (0.74), 8.764 (3.04), 8.881 (0.82), 8.901 (0.79).
79	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.67 min; MS (ESIpos): m/z = 502 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.20), 0.008 (2.00), 1.091 (1.05), 1.157 (1.00), 1.175 (2.17), 1.193 (1.28), 1.234 (2.13), 1.391 (1.14), 1.908 (3.71), 1.916 (4.42), 1.924 (10.00), 1.932 (4.39), 1.941 (3.75), 1.956 (1.50), 1.968 (1.88), 2.462 (0.91), 2.472 (1.20), 2.689 (7.43), 2.825 (0.94), 2.845 (1.20), 2.865 (1.56), 2.965 (0.92), 2.977 (0.96), 3.288 (1.30), 3.650 (3.10), 3.666 (7.98), 3.682 (2.94), 5.489 (1.79), 5.509 (1.80), 7.211 (2.58), 7.215 (2.00), 7.221 (3.24), 7.228 (2.98), 7.231 (3.71), 7.233 (3.97), 7.245 (1.09), 7.259 (2.43), 7.271 (1.46), 7.356 (1.78), 7.365 (1.99), 7.377 (1.40), 7.477 (1.97), 7.495 (2.48), 7.498 (2.33), 7.516 (2.30), 7.604 (1.42), 7.610 (3.39), 7.614 (5.27), 7.620 (16.00), 7.624 (6.54), 7.709 (2.80), 7.713 (3.02), 7.727 (2.49), 7.731 (2.42), 8.263 (2.41), 8.266 (2.49), 8.284 (2.32), 8.288 (2.22), 8.452 (9.01), 8.878 (2.24), 8.899 (2.20).

[1859]

80	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.91 min; MS (ES pos): m/z = 546 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.90), -0.008 (7.64), 0.008 (7.69), 0.146 (0.95), 1.175 (0.44), 1.236 (2.24), 1.879 (1.70), 1.916 (1.03), 1.936 (0.98), 1.950 (0.87), 1.988 (0.77), 1.988 (0.87), 2.327 (1.38), 2.366 (1.49), 2.523 (5.17), 2.670 (1.57), 2.710 (1.16), 2.815 (0.49), 2.835 (0.85), 2.855 (1.11), 2.874 (1.26), 2.893 (0.67), 2.959 (0.72), 2.972 (0.87), 2.981 (0.80), 2.993 (0.90), 3.021 (0.54), 3.798 (0.87), 3.816 (0.93), 4.640 (1.05), 4.654 (1.23), 4.662 (1.13), 5.511 (0.54), 5.530 (1.39), 5.549 (1.36), 5.567 (0.54), 7.231 (2.24), 7.240 (2.39), 7.248 (3.68), 7.253 (2.98), 7.271 (2.68), 7.285 (1.05), 7.446 (1.44), 7.453 (1.57), 7.467 (1.34), 7.629 (1.65), 7.640 (16.00), 7.667 (1.67), 7.801 (2.32), 7.816 (1.85), 8.282 (1.65), 8.301 (1.57), 8.695 (6.92), 12.590 (0.62).
81	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.92 min; MS (ES pos): m/z = 478 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.26), 0.008 (1.50), 3.074 (16.00), 4.253 (0.86), 4.262 (0.91), 5.754 (4.63), 6.778 (0.85), 6.781 (0.95), 6.799 (0.99), 6.801 (1.02), 6.913 (0.95), 6.917 (0.94), 6.932 (0.59), 7.164 (0.79), 7.343 (0.82), 7.648 (0.69), 7.665 (1.10), 7.669 (0.79), 7.687 (1.14), 7.721 (1.10), 7.725 (1.20), 7.739 (0.70), 7.743 (0.63), 8.265 (0.99), 8.269 (1.00), 8.286 (0.94), 8.290 (0.86), 8.566 (3.67), 9.075 (0.84), 9.096 (0.82).
82	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.08 min; MS (ES pos): m/z = 520 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 3.288 (1.60), 3.300 (2.14), 3.311 (16.00), 3.865 (1.20), 3.877 (2.00), 3.888 (1.13), 6.780 (0.66), 6.783 (0.71), 6.800 (0.74), 6.803 (0.77), 6.922 (0.70), 6.925 (0.69), 7.365 (0.70), 7.720 (0.80), 7.741 (0.83), 7.764 (0.84), 7.768 (0.91), 8.304 (0.65), 8.308 (0.66), 8.325 (0.62), 8.635 (2.82), 9.161 (0.64).
83	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.26 min; MS (ES pos): m/z = 568 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (3.64), 0.008 (3.64), 1.988 (0.96), 2.038 (0.93), 2.045 (0.98), 2.057 (1.02), 2.073 (1.49), 2.080 (1.22), 2.189 (0.93), 2.203 (1.36), 2.215 (1.27), 2.224 (1.27), 3.259 (1.29), 3.277 (3.60), 3.290 (8.31), 3.334 (2.18), 3.610 (5.58), 3.867 (6.16), 3.880 (11.07), 3.882 (6.04), 4.234 (2.20), 4.241 (1.69), 4.254 (2.29), 4.261 (2.71), 4.269 (2.31), 4.275 (1.84), 4.285 (1.84), 5.232 (0.89), 5.247 (2.02), 5.267 (2.02), 5.281 (0.89), 6.665 (0.98), 6.706 (1.07), 6.779 (3.53), 6.782 (3.93), 6.800 (4.02), 6.803 (4.29), 6.901 (1.93), 6.904 (1.98), 6.919 (3.93), 6.922 (3.96), 6.938 (2.44), 6.941 (2.38), 7.146 (1.98), 7.150 (2.13), 7.167 (3.18), 7.185 (1.62), 7.189 (1.60), 7.363 (3.33), 7.380 (3.22), 7.384 (3.18), 7.389 (2.04), 7.409 (4.31), 7.426 (3.07), 7.429 (3.18), 7.466 (2.24), 7.471 (2.76), 7.482 (2.33), 7.486 (3.64), 7.490 (1.80), 7.502 (1.51), 7.506 (1.38), 7.602 (1.44), 7.620 (2.38), 7.640 (1.22), 7.704 (2.67), 7.722 (4.38), 7.725 (3.36), 7.742 (4.40), 7.779 (4.49), 7.783 (5.00), 7.797 (2.96), 7.800 (2.76), 8.308 (3.76), 8.312 (3.84), 8.329 (3.56), 8.333 (3.38), 8.612 (16.00), 9.161 (3.69), 9.182 (3.62).
84	LC-MS (方法 L5): Rt = 0.69 min; MS (ES pos): m/z = 517 [M+H] ⁺	
85	LC-MS (方法 L5): Rt = 1.38 min; MS (ES pos): m/z = 564 [M+H] ⁺	
86	LC-MS (方法 L5): Rt = 1.20 min; MS (ES pos): m/z = 524 [M+H] ⁺	

[1860]

87			LC-MS (方法 L5); Rt = 1.25 min; MS (ESIpos); m/z = 519 [M+H] ⁺
88	1,3		LC-MS (方法 L5); Rt = 0.71 min; MS (ESIpos); m/z = 519 [M+H] ⁺
89	2,2		LC-MS (方法 L5); Rt = 0.95 min; MS (ESIpos); m/z = 506 [M+H] ⁺
90	4,9		LC-MS (方法 L5); Rt = 1.33 min; MS (ESIpos); m/z = 534 [M+H] ⁺
91	2,9		LC-MS (方法 L5); Rt = 1.12 min; MS (ESIpos); m/z = 546 [M+H] ⁺
92	2,9		LC-MS (方法 L5); Rt = 1.12 min; MS (ESIpos); m/z = 546 [M+H] ⁺
93			LC-MS (方法 L5); Rt = 1.33 min; MS (ESIpos); m/z = 564 [M+H] ⁺
94			LC-MS (方法 L5); Rt = 0.72 min; MS (ESIpos); m/z = 545 [M+H] ⁺
95			LC-MS (方法 L5); Rt = 0.96 min; MS (ESIpos); m/z = 532 [M+H] ⁺

[1861]

96	1,4	LC-MS (方法 L5): Rt = 0.74 min; MS (ESIpos); m/z = 545 [M+H] ⁺	
97		LC-MS (方法 L5): Rt = 1.01 min; MS (ESIpos); m/z = 544 [M+H] ⁺	
98		LC-MS (方法 L5): Rt = 0.90 min; MS (ESIpos); m/z = 533 [M+H] ⁺	
99-1	2,2	LC-MS (方法 L5): Rt = 0.97 min; MS (ESIpos); m/z = 539 [M+H] ⁺	
99-2	2,1	LC-MS (方法 L5): Rt = 0.93 min; MS (ESIpos); m/z = 520 [M+H] ⁺	
100	1,9	LC-MS (方法 L5): Rt = 0.87 min; MS (ESIpos); m/z = 492 [M+H] ⁺	
101	1,8	LC-MS (方法 L5): Rt = 0.85 min; MS (ESIpos); m/z = 518 [M+H] ⁺	
102		LC-MS (方法 L5): Rt = 0.85 min; MS (ESIpos); m/z = 504 [M+H] ⁺	
103		LC-MS (方法 L5): Rt = 0.71 min; MS (ESIpos); m/z = 557 [M+H] ⁺	

[1862]

104			LC-MS (方法 L5): Rt = 1.26 min; MS (ESIpos): m/z = 516 [M+H] ⁺	
105			LC-MS (方法 L5): Rt = 1.27 min; MS (ESIpos): m/z = 516 [M+H] ⁺	
106	3.7		LC-MS (方法 L5): Rt = 1.24 min; MS (ESIpos): m/z = 516 [M+H] ⁺	
107			LC-MS (方法 L5): Rt = 1.31 min; MS (ESIpos): m/z = 546 [M+H] ⁺	
108			LC-MS (方法 L5): Rt = 1.03 min; MS (ESIpos): m/z = 504 [M+H] ⁺	
109			LC-MS (方法 L5): Rt = 1.42 min; MS (ESIpos): m/z = 564 [M+H] ⁺	
110			LC-MS (方法 L5): Rt = 1.38 min; MS (ESIpos): m/z = 544 [M+H] ⁺	
111			LC-MS (方法 L5): Rt = 1.00 min; MS (ESIpos): m/z = 550 [M+H] ⁺	
112	2.6		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.10 min; MS (ESIpos): m/z = 538 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (3.14), 0.008 (2.96), 0.146 (0.46), 1.917 (0.92), 1.937 (0.96), 1.949 (1.08), 1.968 (0.98), 2.328 (0.72), 2.568 (1.52), 2.587 (2.01), 2.605 (1.54), 2.624 (0.91), 2.640 (0.62), 2.670 (0.64), 2.849 (0.85), 2.868 (1.12), 2.887 (1.37), 2.908 (0.64), 2.974 (0.91), 2.988 (0.95), 3.707 (1.26), 3.726 (2.13), 3.736 (2.13), 3.753 (1.19), 3.841 (2.10), 3.873 (4.31), 3.905 (2.01), 5.508 (0.54), 5.528 (1.68), 5.549 (1.67), 7.224 (2.73), 7.233 (3.15), 7.241 (3.80), 7.271 (2.34), 7.414 (1.68), 7.429 (1.43), 7.640 (16.00), 7.665 (1.81), 7.684 (2.39), 7.705 (2.19), 7.835 (2.72), 7.850 (2.23), 8.239 (2.35), 8.258 (2.17), 8.695 (9.00), 9.086 (2.09), 9.106 (2.05).

[1863]

113			LC-MS (方法 L5); Rt =1.04 min; MS (ESIpos): m/z = 545 [M+H] ⁺	
114			LC-MS (方法 L5); Rt =1.40 min; MS (ESIpos): m/z = 566 [M+H] ⁺	
115			LC-MS (方法 L5); Rt =1.05 min; MS (ESIpos): m/z = 533 [M+H] ⁺	
116	3,4		LC-MS (方法 L5); Rt =1.25 min; MS (ESIpos): m/z = 559 [M+H] ⁺	
117			LC-MS (方法 L5); Rt =1.25 min; MS (ESIpos): m/z = 565 [M+H] ⁺	
118			LC-MS (方法 L5); Rt =1.33 min; MS (ESIpos): m/z = 552 [M+H] ⁺	
119			LC-MS (方法 L5 方法 L5); Rt =0.92 min; MS (ESIpos): m/z = 506 [M+H] ⁺	
120			LC-MS (方法 L5); Rt =0.94 min; MS (ESIpos): m/z = 502 [M+H] ⁺	
121			LC-MS (方法 L5); Rt =1.00 min; MS (ESIpos): m/z = 524 [M+H] ⁺	

[1864]

122	2	LC-MS (方法 L5): Rt = 0.90 min; MS (ESIpos): m/z = 547 [M+H] ⁺	
123		LC-MS (方法 L5): Rt = 0.98 min; MS (ESIpos): m/z = 544 [M+H] ⁺	
124		LC-MS (方法 L8): Rt = 0.82 min; MS (ESIneg): m/z = 518 [M-H] ⁻	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.007 (0.42), 1.234 (0.43), 1.937 (0.49), 1.954 (1.37), 1.962 (0.72), 1.971 (1.46), 1.979 (1.53), 1.988 (0.69), 1.996 (1.47), 2.013 (0.54), 2.446 (0.68), 2.453 (0.82), 2.462 (1.42), 2.469 (1.84), 2.478 (2.17), 2.518 (7.50), 2.809 (0.67), 2.826 (1.25), 2.842 (1.48), 2.858 (1.88), 2.874 (0.85), 2.960 (1.13), 2.967 (1.21), 2.978 (1.24), 2.984 (1.18), 2.992 (0.89), 2.998 (0.84), 3.009 (0.81), 3.016 (0.70), 3.316 (1.98), 3.664 (0.52), 3.675 (1.21), 3.689 (2.49), 3.701 (2.76), 3.715 (2.35), 3.729 (1.06), 3.740 (0.44), 5.503 (0.84), 5.519 (2.36), 5.535 (2.35), 5.551 (0.79), 6.929 (2.26), 7.192 (0.72), 7.206 (4.09), 7.213 (4.86), 7.220 (5.20), 7.224 (3.60), 7.235 (1.11), 7.255 (3.09), 7.266 (1.77), 7.271 (1.27), 7.362 (2.40), 7.368 (2.53), 7.379 (2.23), 7.400 (2.23), 7.534 (2.37), 7.548 (3.14), 7.550 (2.96), 7.565 (2.60), 7.599 (3.07), 7.603 (6.46), 7.607 (4.90), 7.627 (16.00), 7.631 (11.94), 7.739 (3.66), 7.741 (3.78), 7.754 (3.17), 7.755 (3.13), 7.917 (1.31), 7.928 (2.35), 7.938 (1.20), 8.157 (3.18), 8.334 (3.01), 8.350 (2.81), 8.562 (10.41), 8.850 (3.16), 8.866 (3.04).
125	2,1	LC-MS (方法 L5): Rt = 0.95 min; MS (ESIpos): m/z = 542 [M+H] ⁺	
126		LC-MS (方法 L5): Rt = 0.87 min; MS (ESIpos): m/z = 533 [M+H] ⁺	
127	1,9	LC-MS (方法 L5): Rt = 0.90 min; MS (ESIpos): m/z = 519 [M+H] ⁺	
128	2,1	LC-MS (方法 L5): Rt = 0.97 min; MS (ESIpos): m/z = 520 [M+H] ⁺	
129	1,8	LC-MS (方法 L5): Rt = 0.85 min; MS (ESIpos): m/z = 505 [M+H] ⁺	

[1865]

130		LC-MS (方法 L1): Rt = 0.85 min; MS (ESIpos): m/z = 458 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 3.066 (16.00), 4.262 (0.81), 4.270 (0.92), 5.754 (1.15), 6.784 (0.98), 6.787 (1.02), 6.805 (1.10), 6.807 (1.10), 6.923 (0.99), 6.926 (0.97), 7.169 (0.81), 7.353 (0.82), 7.373 (0.79), 7.455 (0.88), 7.460 (1.48), 7.464 (1.00), 7.469 (1.06), 7.487 (1.54), 7.506 (0.70), 7.532 (0.80), 7.536 (1.38), 7.540 (0.76), 7.554 (0.76), 7.623 (0.73), 7.643 (2.49), 7.648 (1.12), 7.662 (1.03), 7.739 (1.15), 7.743 (1.22), 7.757 (0.88), 7.761 (0.82), 8.204 (1.00), 8.208 (1.02), 8.225 (0.96), 8.229 (0.88), 8.611 (3.90), 9.078 (0.87), 9.088 (0.85).
131		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.40 min; MS (ESIpos): m/z = 494 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.45), 0.008 (2.01), 2.031 (0.91), 2.038 (0.84), 2.086 (1.12), 2.199 (0.70), 3.673 (16.00), 3.742 (5.31), 4.174 (1.20), 4.181 (0.78), 4.195 (0.87), 4.203 (0.99), 4.287 (0.82), 4.296 (0.76), 4.304 (0.93), 5.125 (1.08), 5.142 (1.08), 6.796 (1.69), 6.816 (1.95), 6.878 (0.99), 6.881 (0.91), 6.897 (1.97), 6.916 (1.18), 6.957 (0.91), 6.972 (0.89), 7.152 (1.31), 7.157 (1.12), 7.166 (1.84), 7.171 (2.18), 7.185 (2.45), 7.196 (1.01), 7.206 (1.77), 7.283 (0.80), 7.287 (0.91), 7.294 (1.69), 7.314 (1.54), 7.387 (2.01), 7.391 (1.99), 7.406 (1.77), 7.409 (1.59), 7.445 (2.22), 7.449 (2.24), 7.501 (6.85), 7.506 (6.87), 7.717 (0.85), 7.736 (1.54), 7.741 (2.47), 7.746 (1.27), 7.935 (2.81), 7.951 (2.83), 8.166 (0.63), 8.903 (1.69), 8.921 (1.69), 9.904 (1.94), 9.922 (2.56), 9.934 (1.42).
132		LC-MS (方法 L6): Rt = 2.15 min; MS (ESIpos): m/z = 526 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.84), 0.008 (1.78), 3.075 (16.00), 4.248 (0.91), 4.256 (1.05), 6.774 (1.08), 6.777 (1.18), 6.794 (1.23), 6.797 (1.29), 6.889 (0.56), 6.905 (1.13), 6.908 (1.14), 6.924 (0.71), 6.926 (0.68), 7.142 (0.63), 7.160 (0.95), 7.335 (0.74), 7.468 (0.66), 7.474 (0.64), 7.633 (0.61), 7.650 (1.67), 7.669 (2.82), 7.900 (2.22), 7.906 (2.18), 8.257 (1.14), 8.263 (1.06), 8.276 (1.03), 8.282 (1.00), 8.537 (3.81).
133		LC-MS (方法 L6): Rt = 2.40 min; MS (ESIpos): m/z = 568 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.91), -0.008 (7.68), 0.008 (7.18), 0.146 (0.91), 2.027 (1.24), 2.035 (1.27), 2.046 (1.34), 2.062 (1.88), 2.070 (1.58), 2.078 (1.17), 2.085 (0.81), 2.184 (1.24), 2.196 (1.71), 2.209 (1.71), 2.218 (1.64), 2.230 (1.07), 2.366 (0.70), 2.710 (0.64), 3.247 (1.24), 3.289 (8.35), 3.334 (1.81), 3.866 (8.18), 3.876 (13.05), 3.888 (7.51), 3.906 (0.97), 4.204 (0.74), 4.212 (0.97), 4.224 (0.91), 4.232 (2.85), 4.240 (2.28), 4.252 (3.66), 4.264 (3.52), 4.271 (2.52), 4.280 (2.52), 4.299 (0.94), 5.241 (2.11), 5.255 (2.08), 5.753 (4.53), 6.776 (4.49), 6.779 (5.00), 6.796 (5.20), 6.799 (5.50), 6.896 (2.21), 6.915 (4.70), 6.933 (2.78), 7.142 (2.55), 7.147 (2.72), 7.164 (4.13), 7.181 (2.11), 7.186 (2.01), 7.357 (4.19), 7.374 (3.96), 7.444 (2.25), 7.450 (2.42), 7.476 (2.68), 7.482 (2.58), 7.686 (1.38), 7.703 (7.55), 7.711 (6.74), 7.720 (16.00), 7.728 (1.71), 7.909 (7.31), 7.915 (7.11), 8.282 (0.91), 8.291 (4.49), 8.300 (3.82), 8.307 (3.66), 8.316 (3.89), 8.325 (0.74), 8.606 (7.01), 8.610 (7.75), 9.160 (2.82), 9.181 (2.72).
134	1.9	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.84 min; MS (ESIpos): m/z = 578 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm]= 8.99 (d, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.36 (d, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.83 (br s, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.60 - 7.63 (m, 3H), 7.54 (t, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.16 (t, 1H), 6.91 (t, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.21 - 5.27 (m, 1H), 4.22 - 4.30 (m, 2H), 3.07 (d, 3H), 2.52 - 2.55 (m, 4H), 2.12 - 2.20 (m, 1H), 2.00 - 2.08 (m, 1H).

[1866]

135	1.9	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.89 min, MS (ESipos): m/z = 504 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (6.30), 0.008 (2.98), 2.004 (1.02), 2.014 (0.94), 2.026 (1.43), 2.041 (1.28), 2.126 (1.31), 2.141 (1.56), 2.373 (2.15), 2.394 (2.92), 2.412 (2.16), 2.433 (1.25), 2.519 (4.80), 2.523 (4.67), 4.243 (3.28), 4.255 (4.75), 4.261 (3.01), 4.270 (2.58), 4.427 (5.50), 4.446 (8.06), 4.466 (4.62), 5.160 (0.92), 5.174 (1.75), 5.194 (1.64), 5.754 (2.42), 6.781 (3.04), 6.785 (3.14), 6.802 (3.39), 6.805 (3.26), 6.887 (1.73), 6.890 (1.66), 6.906 (3.30), 6.909 (2.99), 6.924 (1.93), 6.927 (1.70), 7.142 (1.75), 7.146 (1.77), 7.163 (2.63), 7.180 (1.31), 7.185 (1.20), 7.291 (2.83), 7.311 (2.52), 7.434 (2.40), 7.452 (3.13), 7.455 (2.90), 7.473 (2.61), 7.592 (2.65), 7.597 (4.87), 7.602 (5.82), 7.611 (16.00), 7.616 (8.48), 7.698 (3.62), 7.701 (3.63), 7.716 (3.07), 7.719 (2.82), 8.058 (3.06), 8.061 (3.05), 8.080 (2.76), 8.083 (2.47), 8.430 (11.34), 8.946 (2.94), 8.966 (2.74).
136	2.1	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.93 min, MS (ESipos): m/z = 541 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ [ppm]: -0.008 (1.56), 0.008 (1.98), 0.069 (0.62), 1.256 (1.23), 1.582 (16.00), 2.171 (1.20), 2.177 (0.59), 5.289 (1.83), 6.997 (0.57), 7.429 (0.69), 7.519 (1.23).
137	4.8	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.42 min, MS (ESipos): m/z = 564 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.04), 0.008 (1.38), 1.199 (3.32), 1.216 (7.07), 1.234 (3.34), 2.086 (1.65), 3.048 (8.16), 4.052 (4.09), 4.134 (0.95), 4.152 (2.94), 4.169 (2.79), 4.187 (0.86), 4.283 (1.07), 6.790 (1.19), 6.793 (1.25), 6.810 (1.31), 6.813 (1.32), 6.917 (1.20), 6.920 (1.17), 7.175 (0.96), 7.378 (0.94), 7.645 (16.00), 7.689 (0.97), 7.707 (1.22), 7.710 (1.08), 7.728 (1.19), 7.840 (1.33), 7.843 (1.41), 7.858 (1.10), 7.861 (1.03), 8.354 (1.21), 8.358 (1.23), 8.375 (1.10), 8.379 (1.01), 8.756 (4.67), 9.196 (1.08), 9.217 (1.02).
138	2.7	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.12 min, MS (ESipos): m/z = 522 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.087 (0.95), 2.095 (0.79), 2.206 (0.84), 2.218 (0.81), 2.228 (0.77), 3.056 (16.00), 3.516 (1.41), 3.529 (3.23), 3.541 (2.52), 3.601 (1.41), 3.614 (2.77), 3.628 (2.42), 3.641 (0.85), 4.245 (1.32), 4.253 (1.18), 4.265 (2.15), 4.274 (2.23), 4.290 (1.20), 5.100 (1.14), 5.115 (2.39), 5.130 (1.09), 5.279 (1.29), 5.298 (1.29), 5.752 (1.32), 5.754 (1.27), 6.792 (2.55), 6.813 (2.83), 6.910 (1.24), 6.928 (2.57), 6.947 (1.49), 7.159 (1.29), 7.176 (2.06), 7.197 (0.97), 7.357 (2.18), 7.376 (1.99), 7.625 (2.25), 7.628 (2.63), 7.631 (3.12), 7.634 (5.58), 7.638 (12.01), 7.640 (9.99), 7.643 (5.84), 7.646 (4.00), 7.665 (1.93), 7.801 (2.81), 7.819 (2.22), 8.275 (2.37), 8.296 (2.15), 8.673 (7.74), 9.303 (2.25), 9.323 (2.20).
139		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.33 min, m/z = 510/512 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.29 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 1H), 7.77 - 7.68 (m, 2H), 7.61 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.47 - 7.41 (m, 1H), 7.37 - 7.31 (m, 1H), 7.20 - 7.13 (m, 1H), 6.95 - 6.88 (m, 1H), 6.82 - 6.77 (m, 1H), 5.27 - 5.19 (m, 1H), 4.30 - 4.19 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.27 - 2.12 (m, 1H), 2.07 - 1.99 (m, 1H).
140		LC-MS (方法 L2): Rt = 2.98 min, m/z = 478 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.07 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.27 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 1H), 7.64 - 7.48 (m, 3H), 7.34 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.31 - 7.23 (m, 1H), 7.20 - 7.13 (m, 1H), 6.95 - 6.88 (m, 1H), 6.82 - 6.76 (m, 1H), 5.28 - 5.20 (m, 1H), 4.32 - 4.19 (m, 2H), 3.06 (s, 6H), 2.22 - 2.14 (m, 1H), 2.09 - 1.99 (m, 1H).
141		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.03 min, m/z = 476 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.27 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 1H), 7.60 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.55 - 7.45 (m, 3H), 7.43 - 7.31 (m, 2H), 7.20 - 7.12 (m, 1H), 6.95 - 6.88 (m, 1H), 6.83 - 6.76 (m, 1H), 5.28 - 5.19 (m, 1H), 4.32 - 4.19 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.25 - 2.14 (m, 1H), 2.09 - 1.98 (m, 1H).

[1867]

142		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.68 min, m/z = 520 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.67 (s, 1H), 8.34 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 1H), 7.66 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.40 - 7.28 (m, 2H), 7.22 - 7.13 (m, 3H), 6.96 - 6.89 (m, 1H), 6.82 - 6.76 (m, 1H), 5.29 - 5.21 (m, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.88 (q, J = 5.8, 4.5 Hz, 4H), 3.28 (q, J = 4.5 Hz, 4H), 2.27 - 2.16 (m, 1H), 2.10 - 2.00 (m, 1H).
143		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.86 min, m/z = 536 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.68 (s, 1H), 8.34 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 1H), 7.66 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.55 - 7.49 (m, 1H), 7.40 - 7.29 (m, 3H), 7.21 - 7.13 (m, 1H), 6.96 - 6.89 (m, 1H), 6.82 - 6.76 (m, 1H), 5.29 - 5.21 (m, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.87 (t, J = 4.5 Hz, 4H), 3.28 (q, J = 4.6 Hz, 4H), 2.26 - 2.18 (m, 1H), 2.11 - 2.02 (m, 1H).
144		LC-MS (方法 L2): Rt = 4.14 min, m/z = 552/554 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.85 (s, 1H), 7.83 (dd, J = 9.8, 2.9 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 8.6, 2.9 Hz, 1H), 7.45 (dd, J = 8.3, 2.0 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.26 - 7.17 (m, 1H), 6.94 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.87 (dd, J = 8.3, 1.0 Hz, 1H), 6.82 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 5.38 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 4.36 (dq, J = 9.2, 3.4, 2.9 Hz, 1H), 4.20 (ddd, J = 11.6, 9.6, 2.7 Hz, 1H), 3.97 - 3.84 (m, 4H), 3.44 - 3.33 (m, 4H), 2.47 - 2.35 (m, 1H), 2.29 - 2.19 (m, 1H).
145		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.82 min, m/z = 510/512 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.89 (s, 1H), 7.76 (dd, J = 9.9, 2.9 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.49 - 7.43 (m, 2H), 7.29 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.24 - 7.18 (m, 1H), 7.08 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.93 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.88 - 6.84 (m, 1H), 5.40 - 5.33 (m, 1H), 4.38 - 4.31 (m, 1H), 4.23 - 4.16 (m, 1H), 3.10 (s, 6H), 2.44 - 2.34 (m, 1H), 2.25 - 2.16 (m, 1H).
146		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.55 min, m/z = 510/512 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.85 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.81 (dd, J = 10.0, 2.8 Hz, 1H), 7.54 (dd, J = 7.9, 1.6 Hz, 1H), 7.40 (dd, J = 8.3, 2.8 Hz, 1H), 7.34 - 7.15 (m, 4H), 7.07 - 6.97 (m, 1H), 6.91 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.85 (dd, 1H), 5.40 - 5.29 (m, 1H), 4.37 - 4.30 (m, 1H), 4.22 - 4.14 (m, 1H), 3.12 (s, 6H), 2.43 - 2.32 (m, 1H), 2.23 - 2.14 (m, 1H).
147	2.76		¹ H-NMR (399.9532 MHz, DMSO): δ = 9.121 (0.91); 9.1007 (0.93); 8.634 (3.89); 8.3134 (0.72); 8.2547 (0.98); 8.2517 (1.05); 8.2336 (1.09); 8.2306 (1.1); 7.805 (1.01); 7.7903 (1.21); 7.7874 (1.21); 7.6694 (1.03); 7.6485 (1.18); 7.6304 (12.69); 6.8945 (1.38); 6.8875 (1.57); 6.7982 (0.58); 6.7911 (0.47); 6.7761 (1.29); 6.7688 (1.22); 6.7441 (2.53); 6.7219 (1.02); 5.2287 (0.58); 5.2095 (0.58); 4.2178 (0.58); 4.2045 (1.04); 4.1982 (0.85); 4.1864 (0.55); 4.1782 (0.56); 3.6948 (11.21); 3.3162 (70.62); 3.2923 (0.36); 3.0725 (16); 2.6745 (0.55); 2.6703 (0.76); 2.6659 (0.57); 2.5055 (89.32); 2.5011 (123.65); 2.4967 (94.57); 2.3324 (0.52); 2.328 (0.71); 2.3236 (0.52); 2.1952 (0.33); 2.185 (0.35); 2.1736 (0.35); 2.0579 (0.35); 2.0505 (0.41); 1.3981 (6.55); 0.1458 (0.5); 0.008 (4.19); -0.0001 (108.21); -0.0083 (4.43); -0.1497 (0.5)
148	2.84		¹ H-NMR (399.9532 MHz, DMSO): δ = 8.8981 (0.68); 8.8777 (0.7); 8.6125 (3.39); 8.3132 (0.55); 8.2499 (0.74); 8.2465 (0.82); 8.2266 (0.85); 8.2252 (0.85); 7.805 (0.71); 7.8016 (0.8); 7.7871 (0.96); 7.7838 (0.98); 7.6657 (0.85); 7.6476 (0.82); 7.6444 (0.97); 7.6324 (11.7); 7.3105 (0.9); 7.2897 (1); 6.8463 (0.92); 6.8409 (1.09); 6.7994 (0.64); 6.7934 (0.54); 6.7787 (0.58); 6.7727 (0.53); 5.4719 (0.54); 5.4526 (0.54); 3.7345 (9.41); 3.3174 (129.06); 3.0587 (12.87); 3.0247 (0.38); 2.8426 (0.45); 2.8226 (0.35); 2.6747 (0.57); 2.6702 (0.79); 2.6658 (0.58); 2.5368 (0.56); 2.5237 (2.21); 2.5101 (44.34); 2.5056 (94.37); 2.5011 (132.67); 2.4965 (99.85); 2.4921 (48.15); 2.3324 (0.55); 2.3281 (0.77); 2.3234 (0.56); 1.398 (16); 0.1459 (0.57); 0.008 (4.36); -0.0002 (135.3); -0.0084 (4.88); -0.1496 (0.56)

[1868]

149	2.2		LC-MS (方法 L1): Rt = 0.94 min; MS (ESIneg): m/z = 589 [M+H] ⁻	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ [ppm]: 2.171 (1.43), 2.631 (16.00), 3.229 (12.71), 3.305 (1.03), 3.313 (1.03), 4.269 (0.86), 6.828 (1.34), 6.830 (1.40), 6.848 (1.53), 6.851 (1.54), 6.950 (1.41), 6.953 (1.37), 6.969 (0.85), 6.972 (0.79), 7.198 (1.15), 7.327 (1.22), 7.346 (1.12), 7.390 (1.53), 7.395 (2.99), 7.400 (1.71), 7.512 (6.31), 7.517 (5.89), 7.551 (0.97), 7.569 (1.53), 7.572 (1.24), 7.590 (1.44), 7.661 (1.63), 7.665 (1.74), 7.679 (1.23), 7.683 (1.12), 8.058 (1.46), 8.062 (1.45), 8.079 (1.31), 8.083 (1.23), 8.983 (5.10).
150	3.1		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.11 min; MS (ESipos): m/z = 536 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.132 (1.28), 2.205 (1.37), 2.328 (0.59), 3.040 (16.00), 3.931 (0.61), 3.975 (4.59), 3.984 (4.71), 4.281 (3.48), 5.309 (1.69), 5.326 (1.68), 6.779 (2.78), 6.799 (3.08), 6.883 (1.42), 6.901 (2.80), 6.920 (1.72), 7.140 (1.56), 7.159 (2.50), 7.175 (1.25), 7.348 (2.66), 7.365 (2.47), 7.643 (14.76), 7.660 (2.25), 7.678 (2.82), 7.699 (1.88), 7.820 (3.02), 7.835 (2.42), 8.139 (1.05), 8.304 (2.56), 8.326 (2.33), 8.755 (6.56).
151			LC-MS (方法 L6): Rt = 1.55 min; MS (ESipos): m/z = 503 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.73), 0.008 (0.73), 2.827 (5.86), 2.831 (9.97), 2.836 (5.88), 3.063 (16.00), 4.234 (0.56), 4.253 (0.85), 4.262 (0.92), 6.778 (0.94), 6.781 (1.01), 6.799 (1.07), 6.801 (1.08), 6.894 (0.49), 6.897 (0.49), 6.912 (1.00), 6.915 (0.97), 6.931 (0.61), 6.934 (0.57), 7.026 (0.55), 7.043 (0.90), 7.055 (1.02), 7.060 (0.67), 7.082 (0.74), 7.142 (0.50), 7.146 (0.54), 7.164 (0.80), 7.339 (0.78), 7.359 (0.78), 7.606 (0.49), 7.623 (1.27), 7.643 (1.95), 7.650 (1.53), 7.663 (0.52), 8.214 (0.96), 8.220 (0.91), 8.234 (0.91), 8.240 (0.83), 8.542 (4.00), 9.073 (0.89), 9.093 (0.86).
152	3			¹ H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ = 9.0892 (0.94); 9.0691 (0.96); 8.6414 (4.26); 8.2521 (0.97); 8.2488 (1.02); 8.2308 (1.12); 8.2275 (1.08); 7.8117 (0.96); 7.8084 (1.01); 7.7939 (1.28); 7.7906 (1.21); 7.6681 (1.04); 7.65 (1.06); 7.6469 (1.19); 7.633 (1.43); 7.4321 (0.64); 7.4139 (0.79); 7.411 (0.8); 7.3933 (0.66); 6.7953 (0.48); 6.7887 (0.52); 6.774 (0.91); 6.7673 (0.95); 6.7527 (0.46); 6.746 (0.48); 6.6796 (0.98); 6.673 (0.85); 6.6532 (1.02); 6.6466 (0.82); 5.7538 (9.65); 5.2288 (0.51); 5.2099 (0.52); 4.315 (0.48); 4.3057 (0.46); 4.2996 (0.54); 4.2881 (0.57); 4.2791 (0.52); 4.2653 (0.45); 4.2581 (0.58); 3.3173 (12.38); 3.0582 (16); 2.5238 (0.61); 2.5104 (12.16); 2.5059 (24.77); 2.5014 (33.92); 2.4969 (25.2); 2.4926 (12.16); 2.1993 (0.33); 2.1898 (0.34); 2.177 (0.37); 2.078 (0.34); 2.0714 (0.39); 0.008 (1.15); -0.0002 (30.44); -0.0084 (1.11).
153	2.1		LC-MS (方法 L1): Rt = 0.92 min; MS (ESipos): m/z = 492 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.241 (8.09), 1.253 (15.76), 1.265 (7.87), 2.024 (1.23), 2.030 (1.43), 2.037 (1.48), 2.046 (1.79), 2.053 (1.70), 2.146 (1.59), 2.157 (1.87), 2.166 (1.55), 3.508 (1.58), 3.519 (4.30), 3.530 (5.43), 3.540 (4.15), 3.552 (1.33), 4.266 (5.31), 4.273 (4.37), 4.292 (0.68), 5.238 (1.23), 5.248 (2.59), 5.260 (2.52), 5.270 (1.13), 6.788 (4.52), 6.802 (4.77), 6.899 (2.30), 6.912 (4.55), 6.924 (2.56), 7.152 (2.32), 7.165 (3.89), 7.177 (1.93), 7.302 (4.05), 7.315 (3.75), 7.522 (2.63), 7.535 (4.17), 7.548 (2.83), 7.606 (6.74), 7.620 (16.00), 7.662 (0.48), 7.731 (4.94), 7.743 (4.36), 7.808 (2.02), 7.816 (3.34), 8.412 (4.22), 8.426 (4.01), 8.509 (10.45), 9.013 (4.02), 9.027 (3.89).
154			LC-MS (方法 L1): Rt = 0.97 min; MS (ESipos): m/z = 521 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.40), -0.008 (3.14), 0.008 (2.78), 0.833 (0.80), 0.851 (1.18), 1.028 (0.44), 1.103 (0.60), 1.118 (0.70), 1.235 (1.90), 1.874 (16.00), 1.914 (1.00), 2.063 (0.78), 2.108 (1.12), 2.163 (0.90), 2.366 (0.68), 2.518 (4.57), 2.523 (3.14), 2.709 (0.54), 3.508 (0.82), 4.232 (0.58), 4.249 (1.20), 4.258 (1.14), 4.275 (1.58), 4.293 (0.98), 4.302 (1.16), 5.233 (0.52), 5.249 (1.04), 5.266 (1.08), 6.776 (2.22), 6.794 (2.46), 6.877 (1.16), 6.893 (2.38), 6.911 (1.44), 7.135 (1.28), 7.155 (2.02), 7.174 (1.06), 7.340 (1.82), 7.359 (1.74), 7.574 (1.36), 7.592 (1.96), 7.617 (4.01), 7.622 (5.21), 7.628 (11.15), 7.633 (5.41), 7.726 (0.58), 7.789 (2.38), 7.805 (2.08), 8.516 (1.20), 8.538 (1.18), 8.604 (3.14), 9.016 (1.62), 9.036 (1.58), 9.575 (0.84), 10.034 (0.98).

[1869]

155		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.77 min, m/z = 536 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (dd, J = 8.1, 4.5 Hz, 1H), 8.64 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.37 (dd, J = 9.4, 6.3 Hz, 1H), 7.74 - 7.64 (m, 2H), 7.47 - 7.32 (m, 3H), 7.20 - 7.12 (m, 1H), 6.95 - 6.88 (m, 1H), 6.82 - 6.76 (m, 1H), 5.29 - 5.20 (m, 1H), 4.32 - 4.18 (m, 2H), 3.93 - 3.83 (m, 4H), 3.31 - 3.22 (m, 4H), 2.27 - 2.16 (m, 1H), 2.10 - 2.01 (m, 1H).
156		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.96 min, m/z = 552/554 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.33 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 1H), 7.79 - 7.62 (m, 3H), 7.47 - 7.42 (m, 1H), 7.40 - 7.34 (m, 1H), 7.21 - 7.13 (m, 1H), 6.96 - 6.89 (m, 1H), 6.83 - 6.76 (m, 1H), 5.29 - 5.21 (m, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.30 - 3.23 (m, 4H), 2.25 - 2.19 (m, 1H), 2.10 - 2.02 (m, 1H).
157		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.61 min, m/z = 520 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.16 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.36 - 8.28 (m, 1H), 7.65 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.54 (q, J = 8.7 Hz, 2H), 7.41 - 7.25 (m, 2H), 7.21 - 7.13 (m, 1H), 6.92 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.25 (q, J = 5.7 Hz, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.93 - 3.82 (m, 4H), 3.31 - 3.21 (m, 4H), 2.21 (dt, J = 8.6, 4.4 Hz, 1H), 2.11 - 2.00 (m, 1H).
158		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.85 min, m/z = 520 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.86 (s, 1H), 7.82 (dd, J = 9.8, 2.9 Hz, 1H), 7.52 - 7.44 (m, 2H), 7.36 - 7.19 (m, 4H), 6.93 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.89 - 6.80 (m, 2H), 5.43 - 5.34 (m, 1H), 4.41 - 4.32 (m, 1H), 4.24 - 4.15 (m, 1H), 3.96 - 3.84 (m, 4H), 3.44 - 3.33 (m, 4H), 2.46 - 2.36 (m, 1H), 2.28 - 2.19 (m, 1H).
159		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.95 min, m/z = 518 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.85 (s, 1H), 7.81 (dd, J = 9.8, 2.9 Hz, 1H), 7.62 - 7.59 (m, 1H), 7.52 - 7.38 (m, 4H), 7.28 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.24 - 7.18 (m, 1H), 6.96 - 6.83 (m, 3H), 5.43 - 5.30 (m, 1H), 4.40 - 4.31 (m, 1H), 4.25 - 4.15 (m, 1H), 3.96 - 3.83 (m, 4H), 3.44 - 3.31 (m, 4H), 2.45 - 2.34 (m, 1H), 2.28 - 2.17 (m, 1H).
160		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.91 min, m/z = 536 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.83 (s, 1H), 7.87 (dd, J = 9.8, 2.9 Hz, 1H), 7.53 - 7.46 (m, 2H), 7.34 - 7.26 (m, 2H), 7.24 - 7.17 (m, 2H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.89 - 6.80 (m, 2H), 5.40 - 5.33 (m, 1H), 4.39 - 4.31 (m, 1H), 4.23 - 4.12 (m, 1H), 3.96 - 3.84 (m, 4H), 3.44 - 3.33 (m, 4H), 2.44 - 2.34 (m, 1H), 2.26 - 2.18 (m, 1H).
161		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.83 min, m/z = 536 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.82 (s, 1H), 7.89 (dd, J = 9.8, 2.9 Hz, 1H), 7.45 (dd, J = 8.3, 2.9 Hz, 1H), 7.37 - 7.18 (m, 4H), 7.14 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.0 Hz, 1H), 6.79 (s, 1H), 5.41 - 5.34 (m, 1H), 4.39 - 4.31 (m, 1H), 4.22 - 4.14 (m, 1H), 3.97 - 3.87 (m, 4H), 3.47 - 3.34 (m, 4H), 2.45 - 2.35 (m, 1H), 2.26 - 2.18 (m, 1H).
162		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.89 min, m/z = 520 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.86 (s, 1H), 7.84 (dd, J = 9.7, 2.9 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 8.6, 2.9 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.24 - 7.12 (m, 3H), 6.97 - 6.78 (m, 4H), 5.42 - 5.34 (m, 1H), 4.40 - 4.32 (m, 1H), 4.24 - 4.15 (m, 1H), 3.96 - 3.85 (m, 4H), 3.44 - 3.33 (m, 4H), 2.46 - 2.36 (m, 1H), 2.29 - 2.19 (m, 1H).
163		LC-MS (方法 L2): Rt = 4.05 min, m/z = 536 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.85 (s, 1H), 7.84 (dd, J = 9.7, 2.8 Hz, 1H), 7.50 (dd, J = 8.5, 2.8 Hz, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.32 - 7.13 (m, 4H), 6.94 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 6.90 - 6.80 (m, 2H), 5.42 - 5.34 (m, 1H), 4.41 - 4.32 (m, 1H), 4.24 - 4.15 (m, 1H), 3.96 - 3.84 (m, 4H), 3.44 - 3.32 (m, 4H), 2.46 - 2.35 (m, 1H), 2.29 - 2.19 (m, 1H).

[1870]

164	LC-MS (方法 L2): RI = 3.94 min; m/z = 536 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.83 (s, 1H), 7.86 (dd, J = 9.8, 2.9 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 8.3, 2.7 Hz, 1H), 7.44 - 7.36 (m, 2H), 7.28 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.23 - 7.18 (m, 1H), 7.14 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.89 - 6.81 (m, 2H), 5.41 - 5.32 (m, 1H), 4.39 - 4.30 (m, 1H), 4.23 - 4.14 (m, 1H), 3.95 - 3.84 (m, 4H), 3.44 - 3.33 (m, 4H), 2.45 - 2.33 (m, 1H), 2.27 - 2.16 (m, 1H).
165	LC-MS (方法 L2): RI = 3.82 min; m/z = 536 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.83 (s, 1H), 7.87 (dd, J = 9.9, 2.8 Hz, 1H), 7.44 (dd, J = 8.3, 2.8 Hz, 1H), 7.34 - 7.26 (m, 3H), 7.24 - 7.18 (m, 1H), 7.10 (td, J = 8.2, 2.5 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 5.43 - 5.30 (m, 1H), 4.39 - 4.31 (m, 1H), 4.22 - 4.14 (m, 1H), 3.96 - 3.86 (m, 4H), 3.46 - 3.34 (m, J = 3.8 Hz, 4H), 2.45 - 2.35 (m, 1H), 2.27 - 2.17 (m, 1H).
166	LC-MS (方法 L2): RI = 3.95 min; m/z = 552/554 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.80 (s, 1H), 7.87 (dd, J = 9.8, 2.9 Hz, 1H), 7.55 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.43 (dd, J = 8.2, 2.8 Hz, 1H), 7.33 - 7.17 (m, 4H), 6.94 - 6.77 (m, 3H), 5.41 - 5.30 (m, 1H), 4.37 - 4.31 (m, 1H), 4.21 - 4.14 (m, 1H), 3.95 - 3.85 (m, 4H), 3.45 - 3.33 (m, 4H), 2.44 - 2.34 (m, 1H), 2.25 - 2.16 (m, 1H).
167	LC-MS (方法 L2): RI = 3.68 min; m/z = 518 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.32 (dd, J = 9.4, 6.2 Hz, 1H), 7.65 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.56 - 7.47 (m, 3H), 7.43 - 7.34 (m, 2H), 7.21 - 7.14 (m, 1H), 6.97 - 6.89 (m, 1H), 6.80 (d, J = 8.2, 0.9 Hz, 1H), 5.30 - 5.22 (m, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.88 (t, J = 4.6 Hz, 4H), 3.32 - 3.22 (m, 4H), 2.28 - 2.17 (m, 1H), 2.11 - 1.98 (m, 1H).
168	LC-MS (方法 L2): RI = 3.07 min; m/z = 478 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.33 - 8.25 (m, 1H), 7.60 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.38 - 7.27 (m, 2H), 7.22 - 7.12 (m, 3H), 6.95 - 6.88 (m, 1H), 6.82 - 6.76 (m, 1H), 5.27 - 5.19 (m, 1H), 4.32 - 4.19 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.25 - 2.14 (m, 1H), 2.09 - 1.98 (m, 1H).
169	LC-MS (方法 L2): RI = 3.26 min; m/z = 494 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.33 - 8.26 (m, 1H), 7.61 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 7.54 - 7.49 (m, 1H), 7.39 - 7.28 (m, 3H), 7.20 - 7.13 (m, 1H), 6.95 - 6.88 (m, 1H), 6.82 - 6.76 (m, 1H), 5.27 - 5.19 (m, 1H), 4.32 - 4.19 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.25 - 2.14 (m, 1H), 2.09 - 1.99 (m, 1H).
170	LC-MS (方法 L2): RI = 3.82 min; m/z = 536 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (dd, J = 8.1, 3.6 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.37 (dd, J = 9.4, 6.3 Hz, 1H), 7.68 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 7.63 - 7.49 (m, 2H), 7.46 - 7.34 (m, 2H), 7.17 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.30 - 5.21 (m, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.88 (t, J = 4.3 Hz, 4H), 3.32 - 3.23 (m, 4H), 2.21 (d, J = 3.1 Hz, 1H), 2.06 (d, J = 6.4 Hz, 1H).
171	LC-MS (方法 L2): RI = 3.23 min; m/z = 494 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (dd, J = 8.1, 4.3 Hz, 1H), 8.56 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.34 (dd, J = 9.4, 6.3 Hz, 1H), 7.74 - 7.59 (m, 2H), 7.46 - 7.31 (m, 3H), 7.16 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.28 - 5.18 (m, 1H), 4.32 - 4.18 (m, 2H), 3.08 (s, 6H), 2.19 (dd, J = 9.0, 4.8 Hz, 1H), 2.09 - 2.00 (m, 1H).
172	LC-MS (方法 L2): RI = 3.05 min; m/z = 494 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.07 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 8.53 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.31 (dd, J = 9.5, 6.3 Hz, 1H), 7.64 - 7.56 (m, 2H), 7.47 - 7.38 (m, 1H), 7.38 - 7.29 (m, 2H), 7.19 - 7.12 (m, 1H), 6.94 - 6.86 (m, 1H), 6.81 - 6.75 (m, 1H), 5.22 (q, J = 6.8, 6.3 Hz, 1H), 4.31 - 4.18 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.24 - 2.13 (m, 1H), 2.07 - 1.98 (m, 1H).

[1871]

173		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.40 min; m/z = 478 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.91 (s, 1H), 7.75 (dd, J = 9.9, 2.9 Hz, 1H), 7.52 - 7.44 (m, 2H), 7.36 - 7.18 (m, 4H), 7.11 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 6.93 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.87 (dd, J = 8.3, 1.0 Hz, 1H), 5.40 - 5.33 (m, 1H), 4.39 - 4.31 (m, 1H), 4.23 - 4.15 (m, 1H), 3.10 (s, 6H), 2.44 - 2.35 (m, 1H), 2.25 - 2.17 (m, 1H).
174		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.46 min; m/z = 476 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.93 (s, 1H), 7.75 (dd, J = 9.9, 2.9 Hz, 1H), 7.62 - 7.59 (m, 1H), 7.52 - 7.46 (m, 2H), 7.44 - 7.39 (m, 2H), 7.30 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.24 - 7.18 (m, 1H), 7.12 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.93 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.87 (dd, J = 8.3, 1.0 Hz, 1H), 5.41 - 5.34 (m, 1H), 4.39 - 4.31 (m, 1H), 4.23 - 4.16 (m, 1H), 3.10 (s, 6H), 2.44 - 2.35 (m, 1H), 2.25 - 2.17 (m, 1H).
175		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.59 min; m/z = 494 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.88 (s, 1H), 7.81 (dd, J = 10.0, 2.9 Hz, 1H), 7.51 - 7.45 (m, 2H), 7.34 - 7.27 (m, 2H), 7.23 - 7.17 (m, 2H), 7.04 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.2, 1.1 Hz, 1H), 5.40 - 5.33 (m, 1H), 4.38 - 4.31 (m, 1H), 4.22 - 4.15 (m, 1H), 3.11 (s, 6H), 2.43 - 2.34 (m, 1H), 2.24 - 2.16 (m, 1H).
176		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.40 min; m/z = 494 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.86 (s, 1H), 7.82 (dd, J = 10.0, 2.9 Hz, 1H), 7.42 (dd, J = 8.3, 2.9 Hz, 1H), 7.37 - 7.30 (m, 1H), 7.29 - 7.12 (m, 4H), 7.02 (s, 1H), 6.91 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.85 (dd, J = 8.3, 1.0 Hz, 1H), 5.40 - 5.32 (m, 1H), 4.37 - 4.30 (m, 1H), 4.22 - 4.14 (m, 1H), 3.12 (s, 6H), 2.42 - 2.33 (m, 1H), 2.23 - 2.15 (m, 1H).
177		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.51 min; m/z = 478 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.91 (s, 1H), 7.78 (dd, J = 9.9, 2.9 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 8.6, 2.9 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.24 - 7.13 (m, 3H), 7.04 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 6.94 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.91 - 6.84 (m, 2H), 5.41 - 5.34 (m, 1H), 4.39 - 4.32 (m, 1H), 4.24 - 4.16 (m, 1H), 3.11 (s, 6H), 2.44 - 2.35 (m, 1H), 2.25 - 2.17 (m, 1H).
178		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.73 min; m/z = 494 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.90 (s, 1H), 7.77 (dd, J = 9.9, 2.9 Hz, 1H), 7.47 (dd, J = 8.6, 2.9 Hz, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.32 - 7.24 (m, 2H), 7.24 - 7.18 (m, 1H), 7.15 (dt, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.05 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.93 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 0.9 Hz, 1H), 5.40 - 5.33 (m, 1H), 4.38 - 4.31 (m, 1H), 4.23 - 4.16 (m, 1H), 3.10 (s, 6H), 2.44 - 2.34 (m, 1H), 2.25 - 2.16 (m, 1H).
179		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.63 min; m/z = 494 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.88 (s, 1H), 7.80 (dd, J = 10.0, 2.9 Hz, 1H), 7.48 (dd, J = 8.3, 2.8 Hz, 1H), 7.44 - 7.35 (m, 2H), 7.28 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.23 - 7.17 (m, 1H), 7.13 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 7.04 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.0 Hz, 1H), 5.39 - 5.33 (m, 1H), 4.38 - 4.30 (m, 1H), 4.22 - 4.14 (m, 1H), 3.11 (s, 6H), 2.43 - 2.34 (m, 1H), 2.24 - 2.16 (m, 1H).
180		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.34 min; m/z = 494 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.87 (s, 1H), 7.81 (dd, J = 10.0, 2.9 Hz, 1H), 7.41 (dd, J = 8.3, 2.9 Hz, 1H), 7.34 - 7.26 (m, 3H), 7.23 - 7.18 (m, 1H), 7.12 - 7.00 (m, 2H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.1 Hz, 1H), 5.40 - 5.33 (m, 1H), 4.38 - 4.30 (m, 1H), 4.22 - 4.14 (m, 1H), 3.12 (s, 6H), 2.43 - 2.34 (m, 1H), 2.24 - 2.15 (m, 1H).

[1872]

181		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.37 min; MS (ESIpos): m/z = 550 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.14), 0.008 (1.84), 1.356 (0.66), 2.056 (0.64), 2.064 (0.68), 2.075 (0.73), 2.091 (1.03), 2.099 (0.87), 2.106 (0.63), 2.192 (0.43), 2.201 (0.68), 2.213 (0.94), 2.225 (0.91), 2.235 (0.85), 2.247 (0.57), 2.255 (0.46), 2.523 (1.40), 2.899 (3.69), 3.449 (0.46), 3.461 (0.72), 3.480 (2.72), 3.492 (5.13), 3.504 (4.92), 3.515 (2.44), 3.535 (0.65), 4.230 (0.50), 4.251 (1.50), 4.259 (1.25), 4.272 (2.17), 4.281 (2.06), 4.298 (1.28), 4.317 (0.65), 5.255 (1.41), 5.274 (1.39), 5.288 (0.61), 6.792 (2.63), 6.810 (2.75), 6.812 (2.85), 6.918 (1.30), 6.921 (1.35), 6.937 (2.66), 6.939 (2.66), 6.955 (1.62), 6.958 (1.57), 7.156 (1.35), 7.160 (1.44), 7.177 (2.18), 7.194 (1.07), 7.198 (1.05), 7.389 (2.31), 7.407 (2.12), 7.632 (5.83), 7.636 (16.00), 7.638 (8.92), 7.689 (1.90), 7.707 (2.69), 7.710 (2.47), 7.728 (2.42), 7.832 (3.00), 7.835 (3.26), 7.850 (2.42), 7.853 (2.35), 8.260 (2.52), 8.263 (2.63), 8.281 (2.36), 8.284 (2.26), 8.718 (9.84), 9.157 (2.51), 9.177 (2.41).
182	3,3	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.08 min; MS (ESIpos): m/z = 578 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.74), 0.008 (0.62), 1.407 (16.00), 2.086 (0.51), 2.523 (0.47), 4.258 (0.40), 4.268 (1.03), 4.283 (0.99), 4.289 (0.91), 4.305 (0.58), 6.787 (0.58), 6.806 (0.68), 6.893 (0.65), 7.167 (0.52), 7.328 (0.53), 7.347 (0.50), 7.578 (0.54), 7.599 (0.48), 7.611 (0.71), 7.615 (0.79), 7.626 (2.75), 7.631 (1.63), 7.769 (0.69), 7.787 (0.59), 8.210 (0.42), 8.334 (0.53), 8.355 (0.50), 8.579 (1.74), 9.051 (0.51), 9.072 (0.50).
183	6	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.49 min; MS (ESIpos): m/z = 592 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.431 (16.00), 3.042 (4.04), 3.948 (2.03), 4.284 (0.56), 6.792 (0.61), 6.811 (0.68), 6.911 (0.63), 7.173 (0.49), 7.354 (0.52), 7.373 (0.48), 7.644 (7.05), 7.683 (0.45), 7.701 (0.62), 7.722 (0.55), 7.837 (0.68), 7.840 (0.68), 7.855 (0.56), 7.858 (0.51), 8.350 (0.60), 8.353 (0.58), 8.371 (0.56), 8.374 (0.52), 8.763 (2.16), 9.234 (0.57), 9.254 (0.55).
184	3	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.95 min; MS (ESIpos): m/z = 506 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (1.32), 0.912 (7.39), 0.931 (16.00), 0.949 (7.79), 1.634 (0.73), 1.652 (2.85), 1.670 (5.25), 1.688 (5.08), 1.706 (2.51), 1.725 (0.52), 2.008 (0.45), 2.024 (0.86), 2.033 (1.06), 2.042 (1.11), 2.058 (1.52), 2.068 (1.52), 2.086 (3.21), 2.126 (0.70), 2.138 (1.27), 2.155 (1.51), 2.167 (1.10), 2.178 (0.76), 2.328 (0.44), 2.523 (2.24), 2.670 (0.48), 3.451 (1.52), 3.468 (3.30), 3.476 (3.00), 3.482 (2.99), 3.489 (3.03), 3.506 (1.25), 4.235 (0.77), 4.253 (2.65), 4.268 (4.11), 4.278 (3.48), 4.286 (2.21), 4.306 (0.49), 5.236 (1.01), 5.251 (2.08), 5.269 (1.99), 5.284 (0.85), 5.754 (0.58), 6.782 (3.55), 6.803 (3.93), 6.880 (1.99), 6.899 (3.97), 6.917 (2.28), 7.141 (1.96), 7.145 (1.96), 7.162 (3.10), 7.180 (1.49), 7.287 (3.39), 7.305 (3.06), 7.516 (2.25), 7.535 (3.39), 7.555 (2.58), 7.600 (3.94), 7.605 (3.48), 7.621 (14.17), 7.626 (9.44), 7.732 (4.27), 7.750 (3.54), 7.951 (2.25), 8.412 (3.35), 8.433 (3.11), 8.535 (9.75), 8.986 (3.00), 9.006 (2.85).
185	2	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.72 min; MS (ESIneg): m/z = 505 [M+H] ⁻	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.108 (4.30), 1.783 (2.07), 1.917 (2.11), 1.930 (1.65), 2.075 (1.64), 2.086 (5.94), 2.156 (1.41), 2.171 (1.60), 2.185 (1.08), 2.328 (0.70), 2.366 (0.42), 2.670 (0.85), 2.709 (0.44), 2.752 (4.01), 2.770 (0.64), 2.789 (0.58), 2.994 (3.16), 3.009 (6.19), 3.024 (3.45), 3.168 (0.68), 3.417 (1.38), 3.527 (1.42), 3.731 (1.06), 4.266 (4.94), 5.247 (2.07), 5.260 (1.94), 5.754 (8.83), 6.786 (3.64), 6.806 (4.14), 6.897 (1.83), 6.916 (3.84), 6.934 (2.23), 7.150 (1.96), 7.167 (3.21), 7.186 (1.56), 7.323 (3.41), 7.341 (3.12), 7.540 (2.24), 7.559 (2.41), 7.579 (2.41), 7.611 (7.22), 7.617 (16.00), 7.746 (4.79), 7.763 (4.88), 8.346 (1.16), 8.400 (0.60), 8.421 (3.41), 8.442 (3.22), 8.513 (7.91), 8.538 (1.10), 9.052 (1.55), 9.069 (1.55).

[1873]

186		LC-MS (方法 L1): Rt = 0.80 min; MS (ESipos): m/z = 534 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.48), 0.008 (3.60), 0.146 (0.48), 1.140 (6.02), 1.235 (0.55), 1.889 (1.18), 2.031 (2.12), 2.051 (2.52), 2.063 (2.18), 2.073 (1.69), 2.116 (2.61), 2.156 (1.44), 2.170 (1.66), 2.186 (0.98), 2.206 (0.83), 2.327 (1.00), 2.366 (0.43), 2.669 (1.05), 2.710 (0.52), 3.475 (2.09), 3.503 (2.40), 3.737 (1.58), 3.759 (1.14), 3.813 (0.91), 3.835 (1.75), 3.865 (2.04), 3.877 (2.60), 3.892 (1.74), 3.903 (1.61), 4.254 (3.26), 4.266 (5.15), 4.280 (3.06), 4.366 (2.18), 4.538 (0.55), 5.032 (2.78), 5.207 (0.85), 5.221 (1.83), 5.241 (1.89), 5.255 (0.85), 6.781 (3.54), 6.801 (1.71), 6.910 (3.70), 6.929 (2.12), 7.145 (1.81), 7.162 (2.90), 7.183 (1.41), 7.305 (3.14), 7.324 (2.84), 7.464 (2.18), 7.482 (3.14), 7.503 (2.58), 7.606 (4.72), 7.610 (4.81), 7.621 (16.00), 7.625 (9.59), 7.706 (3.90), 7.724 (3.35), 8.133 (13.65), 8.279 (3.24), 8.299 (3.04), 8.434 (10.50), 9.044 (3.03), 9.065 (2.98), 12.729 (0.68).
187		LC-MS (方法 L1): Rt = 0.80 min; MS (ESipos): m/z = 534 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.83), -0.008 (7.47), 0.008 (6.76), 0.146 (0.89), 1.235 (0.41), 1.260 (2.01), 1.335 (2.31), 1.901 (1.24), 2.005 (1.48), 2.017 (2.25), 2.028 (2.37), 2.040 (2.49), 2.049 (2.61), 2.085 (0.53), 2.149 (1.42), 2.167 (1.24), 2.185 (1.19), 2.200 (0.89), 2.327 (1.36), 2.366 (0.83), 2.523 (4.80), 2.670 (1.60), 2.710 (1.07), 3.501 (1.84), 3.527 (2.07), 3.732 (1.54), 3.780 (1.01), 3.800 (1.78), 3.821 (1.54), 3.852 (1.72), 3.879 (1.54), 3.889 (1.42), 4.258 (5.39), 4.270 (3.32), 4.374 (2.31), 5.029 (3.67), 5.037 (3.61), 5.197 (0.89), 5.212 (2.01), 5.231 (2.07), 5.246 (0.95), 5.753 (6.18), 6.782 (3.61), 6.803 (4.09), 6.895 (1.84), 6.913 (3.97), 6.932 (2.31), 7.147 (1.96), 7.165 (3.20), 7.182 (1.60), 7.310 (3.38), 7.328 (3.08), 7.463 (1.72), 7.483 (2.79), 7.503 (2.13), 7.609 (3.08), 7.621 (16.00), 7.625 (9.84), 7.709 (3.67), 7.725 (3.20), 8.132 (2.01), 8.276 (3.08), 8.297 (2.90), 8.428 (6.76), 9.044 (2.37), 9.065 (2.37), 12.724 (0.71).
188	4,5	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.18 min; MS (ESineg): m/z = 514 [M-H] ⁻	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.51), 0.008 (2.40), 1.778 (0.76), 1.789 (0.83), 1.806 (1.00), 1.999 (0.94), 2.012 (0.94), 2.020 (0.92), 2.034 (0.71), 2.327 (0.91), 2.670 (1.00), 4.034 (0.75), 4.055 (1.64), 4.076 (1.16), 4.161 (1.16), 4.171 (1.05), 4.179 (1.30), 4.198 (0.76), 5.017 (0.70), 5.031 (1.46), 5.050 (1.46), 5.065 (0.67), 5.754 (0.43), 6.746 (2.94), 6.766 (3.26), 6.848 (1.33), 6.868 (2.92), 6.885 (1.86), 7.049 (2.67), 7.066 (2.16), 7.127 (1.46), 7.148 (2.40), 7.165 (1.19), 7.419 (2.81), 7.438 (3.05), 7.721 (4.19), 7.724 (6.58), 7.730 (16.00), 7.734 (7.25), 7.816 (2.30), 7.835 (3.08), 7.856 (2.38), 8.049 (3.13), 8.052 (3.29), 8.067 (2.75), 8.136 (6.83), 8.138 (6.75), 8.649 (6.74), 8.652 (6.63), 9.105 (2.64), 9.125 (2.56), 9.233 (10.60).
189	5	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.27 min; MS (ESipos): m/z = 534 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 9.12 - 9.22 (m, 2H), 8.35 (s, 2H), 8.03 (dd, 1H), 7.88 - 7.96 (m, 1H), 7.79 - 7.88 (m, 1H), 7.67 - 7.76 (m, 2H), 7.25 (d, 1H), 7.11 - 7.20 (m, 1H), 6.88 - 6.97 (m, 1H), 6.76 (d, 1H), 5.01 - 5.13 (m, 1H), 4.07 - 4.28 (m, 2H), 2.02 - 2.15 (m, 1H), 1.94 (dtd, 1H).
190		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.11 min; MS (ESipos): m/z = 518 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (1.34), 0.008 (11.80), 0.146 (1.34), 1.234 (0.47), 2.050 (1.17), 2.058 (1.31), 2.072 (1.34), 2.085 (1.95), 2.210 (1.70), 2.222 (1.64), 2.231 (1.56), 2.245 (1.09), 2.327 (1.39), 2.366 (0.75), 2.523 (4.79), 2.669 (1.47), 2.710 (0.78), 3.060 (0.45), 3.162 (0.56), 3.174 (0.58), 3.249 (1.59), 3.269 (5.20), 3.280 (11.55), 3.291 (13.72), 3.864 (8.68), 3.875 (14.11), 3.886 (8.04), 4.223 (0.95), 4.244 (2.73), 4.252 (2.17), 4.265 (3.56), 4.293 (2.25), 4.312 (0.81), 5.245 (1.11), 5.259 (2.50), 5.277 (2.50), 5.292 (1.09), 5.754 (0.53), 6.788 (4.59), 6.809 (5.04), 6.917 (2.25), 6.933 (4.79), 6.952 (2.87), 7.157 (2.56), 7.175 (4.03), 7.192 (1.98), 7.377 (4.26), 7.385 (4.01), 7.484 (3.14), 7.506 (6.04), 7.528 (4.70), 7.586 (2.67), 7.591 (2.98), 7.598 (2.95), 7.603 (3.09), 7.612 (2.11), 7.619 (1.89), 7.625 (1.92), 7.673 (3.28), 7.691 (4.84), 7.712 (4.31), 7.796 (8.77), 7.815 (7.35), 8.253 (4.51), 8.256 (4.54), 8.274 (4.20), 8.419 (0.42), 8.679 (16.00), 9.157 (4.45), 9.177 (4.29).

[1874]

191	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.14 min; MS (ESipos): m/z = 536 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 3.284 (1.86), 3.296 (2.09), 3.310 (16.00), 3.864 (1.44), 3.875 (2.23), 3.886 (1.28), 4.236 (0.43), 4.260 (0.54), 5.248 (0.41), 6.782 (0.73), 6.802 (0.80), 6.924 (0.74), 6.941 (0.43), 7.168 (0.63), 7.364 (0.68), 7.383 (0.61), 7.593 (0.46), 7.617 (0.89), 7.641 (0.45), 7.675 (0.47), 7.688 (0.55), 7.695 (0.75), 7.706 (0.80), 7.714 (0.54), 7.726 (0.64), 7.774 (0.85), 7.790 (0.54), 8.295 (0.68), 8.313 (0.62), 8.626 (2.30), 9.156 (0.68), 9.176 (0.65).
192	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.25 min; MS (ESipos): m/z = 552 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.73), 0.008 (0.67), 1.038 (0.70), 1.056 (1.42), 1.073 (0.73), 1.356 (16.00), 2.069 (0.41), 2.183 (2.23), 2.198 (0.40), 2.523 (0.65), 3.162 (5.24), 3.175 (5.43), 3.261 (1.01), 3.272 (2.30), 3.284 (2.43), 3.295 (1.34), 3.862 (1.80), 3.873 (3.10), 3.884 (1.73), 4.062 (0.46), 4.075 (1.30), 4.088 (1.26), 4.101 (0.43), 4.231 (0.62), 4.238 (0.48), 4.252 (0.64), 4.259 (0.79), 4.267 (0.64), 4.274 (0.50), 4.283 (0.53), 4.335 (0.42), 5.238 (0.57), 5.257 (0.58), 6.631 (0.75), 6.784 (1.09), 6.802 (1.21), 6.870 (1.34), 6.902 (0.56), 6.905 (0.54), 6.921 (1.16), 6.939 (0.71), 6.942 (0.64), 7.148 (0.56), 7.152 (0.59), 7.169 (0.92), 7.187 (0.45), 7.190 (0.45), 7.362 (0.95), 7.381 (0.90), 7.502 (2.90), 7.506 (3.06), 7.636 (0.78), 7.659 (1.54), 7.682 (0.86), 7.688 (1.02), 7.693 (1.74), 7.698 (0.87), 8.319 (0.77), 8.334 (0.82), 8.342 (0.81), 8.358 (0.73), 8.680 (4.09), 9.152 (1.05), 9.172 (1.01).
193	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.46 min; MS (ESipos): m/z = 552 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.61), -0.008 (8.00), 0.008 (5.20), 0.146 (0.61), 1.903 (1.83), 2.018 (3.13), 2.029 (3.53), 2.040 (3.33), 2.050 (3.82), 2.156 (2.07), 2.170 (2.36), 2.185 (1.71), 2.327 (2.03), 2.366 (1.50), 2.518 (10.92), 2.523 (9.71), 2.669 (2.07), 2.710 (1.58), 3.472 (1.54), 3.499 (2.56), 3.523 (1.34), 3.736 (2.19), 3.833 (1.71), 3.863 (2.48), 3.876 (2.52), 3.892 (1.83), 4.257 (5.69), 4.266 (6.05), 4.370 (3.09), 5.029 (4.51), 5.220 (2.48), 5.754 (1.38), 6.783 (4.95), 6.802 (5.28), 6.894 (2.88), 6.913 (5.20), 6.931 (3.01), 7.146 (2.30), 7.164 (4.35), 7.184 (1.99), 7.307 (4.39), 7.326 (3.78), 7.461 (2.19), 7.480 (3.49), 7.500 (2.36), 7.721 (4.75), 7.739 (4.06), 7.789 (16.00), 7.805 (15.51), 8.275 (3.57), 8.297 (3.25), 8.439 (5.32), 9.042 (3.25), 9.063 (3.09).
194	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.37 min; MS (ESipos): m/z = 534 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.150 (0.76), 1.243 (1.14), 1.662 (2.65), 1.904 (3.87), 2.034 (6.99), 2.142 (4.04), 2.157 (4.55), 2.327 (2.86), 2.365 (1.05), 2.668 (3.16), 2.689 (9.05), 2.709 (1.60), 2.889 (0.97), 3.508 (3.16), 3.741 (3.75), 3.873 (5.09), 4.249 (14.53), 4.384 (6.23), 5.049 (4.97), 5.203 (5.28), 5.754 (16.00), 6.770 (9.35), 6.791 (10.32), 6.876 (5.64), 6.895 (11.49), 6.912 (6.48), 7.135 (5.73), 7.153 (8.80), 7.172 (4.63), 7.266 (10.78), 7.266 (10.78), 7.305 (12.25), 7.422 (4.88), 7.494 (4.88), 7.537 (6.19), 7.663 (5.05), 8.133 (2.95), 8.331 (10.27), 9.031 (3.83).
195	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.75 min; MS (ESipos): m/z = 536 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (1.44), -0.008 (12.33), 0.008 (10.95), 0.146 (1.32), 1.258 (0.72), 1.902 (4.39), 2.034 (9.32), 2.148 (5.11), 2.164 (5.71), 2.180 (4.39), 2.197 (3.67), 2.327 (4.99), 2.366 (2.71), 2.523 (12.27), 2.670 (4.75), 2.689 (1.26), 2.709 (1.98), 2.812 (0.78), 3.509 (4.03), 3.745 (4.09), 3.874 (7.82), 4.257 (16.00), 4.376 (6.92), 5.037 (7.10), 5.221 (6.32), 5.754 (14.80), 6.777 (11.31), 6.797 (12.27), 6.882 (7.64), 6.901 (15.28), 6.919 (8.84), 7.142 (6.86), 7.159 (10.83), 7.178 (5.23), 7.292 (12.75), 7.311 (11.49), 7.493 (5.29), 7.585 (5.23), 7.664 (9.26), 8.132 (2.05), 8.320 (6.26), 8.361 (10.23), 9.030 (4.45).
196	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.74 min; MS (ESipos): m/z = 518 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.87), 1.913 (2.01), 2.048 (3.88), 2.170 (2.51), 2.327 (1.94), 2.523 (5.82), 2.669 (1.97), 3.516 (1.51), 3.868 (2.41), 4.265 (7.06), 4.377 (3.51), 5.044 (3.01), 5.223 (2.74), 5.754 (16.00), 6.784 (6.46), 6.803 (6.93), 6.892 (3.08), 6.910 (6.43), 6.928 (3.88), 7.147 (3.25), 7.164 (5.12), 7.183 (2.68), 7.301 (4.92), 7.320 (4.62), 7.492 (5.12), 7.567 (3.68), 7.579 (3.75), 7.684 (3.48), 7.701 (3.18), 7.779 (5.82), 7.784 (5.72), 7.798 (5.82), 7.803 (5.62), 8.131 (2.91), 8.260 (2.74), 8.409 (3.45), 9.059 (1.97).

[1875]

197	LC-MS (方法 L1): RT = 0.93 min; MS (ESIpos): m/z = 494 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (0.53), 2.055 (0.47), 2.182 (0.43), 2.523 (1.20), 3.072 (16.00), 4.234 (0.76), 4.241 (0.67), 4.253 (1.11), 4.261 (1.14), 4.276 (0.61), 5.233 (0.66), 5.253 (0.62), 5.754 (0.79), 6.781 (1.22), 6.799 (1.31), 6.895 (0.67), 6.914 (1.23), 6.933 (0.72), 7.147 (0.66), 7.164 (0.99), 7.182 (0.48), 7.342 (1.07), 7.361 (0.96), 7.586 (0.87), 7.609 (1.65), 7.634 (1.59), 7.652 (1.37), 7.668 (1.04), 7.673 (1.40), 7.687 (1.16), 7.707 (0.85), 7.733 (1.36), 7.747 (0.90), 8.252 (1.19), 8.256 (1.15), 8.273 (1.10), 8.558 (4.01), 9.072 (1.07), 9.092 (0.99).
198	LC-MS (方法 L1): RT = 1.17 min; MS (ESIpos): m/z = 506 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.98), 0.008 (2.20), 1.031 (16.00), 1.046 (15.86), 2.114 (0.42), 2.123 (0.49), 2.130 (0.48), 2.180 (0.43), 2.207 (0.73), 2.231 (0.54), 2.290 (0.88), 2.524 (0.71), 2.599 (7.81), 2.716 (2.57), 2.767 (1.36), 2.782 (4.28), 3.063 (13.77), 3.096 (5.64), 3.118 (5.22), 3.128 (2.34), 3.758 (0.72), 3.774 (0.93), 3.789 (0.67), 4.223 (0.45), 4.234 (0.63), 4.240 (0.73), 4.263 (1.22), 4.268 (1.11), 4.291 (0.83), 4.347 (0.83), 4.356 (1.15), 4.374 (0.55), 4.384 (0.64), 6.029 (0.51), 6.045 (0.60), 6.054 (0.62), 6.070 (0.47), 6.750 (0.57), 6.770 (0.61), 6.816 (1.14), 6.836 (1.59), 6.854 (0.46), 6.942 (0.62), 6.952 (0.92), 6.970 (1.59), 6.989 (0.90), 7.088 (0.43), 7.162 (1.02), 7.181 (1.47), 7.200 (0.67), 7.303 (1.07), 7.322 (0.94), 7.359 (0.50), 7.378 (0.44), 7.584 (1.50), 7.588 (2.38), 7.600 (0.65), 7.604 (0.60), 7.623 (0.60), 7.641 (2.51), 7.645 (2.60), 7.653 (1.17), 7.674 (6.23), 7.678 (4.23), 7.684 (1.61), 7.760 (0.60), 7.763 (0.61), 7.778 (0.49), 7.781 (0.49), 7.810 (1.91), 7.828 (1.43), 8.233 (1.73), 8.252 (1.81), 8.270 (0.45), 8.621 (1.03), 8.626 (0.75), 8.649 (1.42), 8.685 (3.00).
199	LC-MS (方法 L1): RT = 1.47 min; MS (ESIpos): m/z = 554 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.524 (0.76), 1.830 (0.77), 1.842 (0.85), 2.669 (0.44), 3.368 (16.00), 3.946 (0.56), 3.970 (1.28), 3.993 (1.00), 4.034 (1.18), 4.049 (1.17), 4.939 (1.39), 4.958 (1.38), 5.753 (0.43), 6.593 (3.28), 6.613 (3.44), 6.720 (2.29), 6.740 (2.71), 6.751 (1.49), 6.769 (2.88), 6.792 (2.81), 6.811 (1.48), 6.997 (1.58), 7.015 (1.39), 7.089 (1.40), 7.123 (3.83), 7.142 (4.69), 7.163 (2.24), 7.676 (2.67), 7.680 (2.28), 7.686 (2.02), 7.707 (3.17), 7.716 (8.16), 7.721 (7.33), 7.909 (2.73), 7.925 (2.29), 7.963 (2.59), 7.984 (2.17), 8.892 (2.25), 8.912 (2.12), 8.993 (6.13).
200	LC-MS (方法 L1): RT = 1.14 min; MS (ESIpos): m/z = 552 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.45), -0.008 (4.14), 0.008 (3.74), 0.146 (0.49), 1.157 (4.28), 1.175 (8.62), 1.192 (4.37), 1.237 (1.13), 1.398 (6.32), 1.988 (16.00), 2.019 (1.27), 2.040 (1.53), 2.054 (1.76), 2.073 (1.64), 2.191 (1.72), 2.204 (1.64), 2.213 (1.69), 2.227 (1.15), 2.327 (1.34), 2.366 (0.92), 2.522 (4.51), 2.669 (1.41), 2.710 (0.92), 3.247 (1.22), 3.265 (2.51), 3.295 (9.16), 3.874 (12.08), 4.002 (1.25), 4.020 (3.83), 4.038 (3.76), 4.056 (1.29), 4.200 (0.85), 4.224 (2.40), 4.249 (3.43), 4.258 (2.82), 4.275 (2.47), 5.230 (2.35), 5.245 (2.44), 5.754 (7.59), 6.774 (5.36), 6.795 (5.92), 6.887 (2.61), 6.905 (5.47), 6.924 (3.27), 7.142 (2.89), 7.159 (4.46), 7.177 (2.21), 7.181 (2.21), 7.344 (6.79), 7.360 (6.16), 7.363 (7.33), 7.370 (3.55), 7.374 (2.84), 7.389 (3.59), 7.393 (3.43), 7.452 (2.96), 7.466 (3.38), 7.472 (4.89), 7.485 (5.24), 7.491 (2.68), 7.505 (2.61), 7.646 (3.76), 7.669 (6.51), 7.691 (3.88), 7.734 (6.13), 7.737 (6.30), 7.754 (5.36), 7.757 (5.12), 8.341 (3.74), 8.356 (3.99), 8.364 (3.95), 8.380 (3.64), 8.604 (9.75), 8.612 (10.24), 9.143 (2.98), 9.149 (3.15), 9.163 (2.98), 9.170 (2.96).

[1876]

201	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.08 min; MS (ESIpos): m/z = 554 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.72), 0.008 (2.48), 2.030 (0.56), 2.039 (0.58), 2.051 (0.60), 2.066 (0.88), 2.073 (0.77), 2.086 (3.11), 2.181 (0.62), 2.193 (0.79), 2.205 (0.79), 2.215 (0.72), 2.227 (0.47), 2.327 (0.60), 2.332 (0.43), 2.523 (1.88), 2.569 (1.25), 2.578 (1.51), 2.596 (1.97), 2.614 (1.49), 2.634 (0.95), 2.651 (0.54), 2.665 (0.50), 2.669 (0.65), 2.674 (0.47), 3.710 (1.27), 3.720 (1.53), 3.728 (2.20), 3.737 (2.18), 3.744 (1.48), 3.755 (1.21), 3.845 (1.98), 3.877 (3.98), 3.909 (1.91), 4.223 (0.41), 4.244 (1.29), 4.252 (1.09), 4.264 (1.96), 4.272 (2.19), 4.287 (1.15), 4.306 (0.42), 5.237 (0.57), 5.251 (1.20), 5.271 (1.20), 5.285 (0.52), 5.754 (4.52), 6.792 (2.31), 6.810 (2.55), 6.812 (2.55), 6.904 (1.13), 6.907 (1.12), 6.923 (2.38), 6.942 (1.43), 6.944 (1.35), 7.156 (1.18), 7.160 (1.25), 7.177 (1.91), 7.195 (0.96), 7.199 (0.91), 7.355 (1.97), 7.373 (1.85), 7.638 (16.00), 7.657 (0.42), 7.664 (1.80), 7.682 (2.37), 7.685 (2.13), 7.703 (2.16), 7.834 (2.60), 7.837 (2.71), 7.852 (2.23), 7.855 (2.07), 8.237 (2.33), 8.240 (2.34), 8.258 (2.24), 8.261 (2.06), 8.688 (8.85), 9.217 (2.14), 9.237 (2.09).
202	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.04 min; MS (ESIpos): m/z = 533 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.84), -0.008 (8.37), 0.008 (8.34), 0.146 (0.90), 0.994 (0.52), 1.236 (1.34), 1.336 (0.57), 1.782 (1.25), 1.916 (1.25), 2.327 (1.74), 2.366 (1.09), 2.670 (1.88), 2.710 (1.09), 2.765 (2.18), 2.781 (4.28), 2.797 (2.15), 3.963 (0.87), 3.984 (2.07), 4.006 (1.34), 4.111 (1.55), 4.873 (1.80), 4.888 (3.60), 4.905 (2.43), 4.921 (1.58), 4.936 (1.88), 4.953 (1.31), 6.688 (3.46), 6.709 (3.87), 6.716 (1.80), 6.735 (3.46), 6.754 (2.51), 6.856 (3.41), 6.875 (2.53), 7.058 (1.66), 7.079 (2.70), 7.097 (1.53), 7.614 (11.50), 7.618 (16.00), 7.636 (4.99), 7.641 (5.42), 7.657 (1.20), 7.680 (1.61), 7.743 (1.77), 7.761 (4.12), 7.781 (3.76), 7.798 (4.58), 7.812 (2.21), 8.383 (2.67), 8.403 (2.70), 8.563 (2.67), 8.580 (2.43), 8.662 (0.57), 9.033 (11.99), 11.367 (0.60).
203	LC-MS (方法 L4): Rt = 3.85 min; MS (ESIpos): m/z = 582 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.008 (2.46), 2.064 (0.79), 2.071 (0.81), 2.084 (0.92), 2.099 (1.21), 2.206 (0.83), 2.218 (1.14), 2.230 (1.08), 2.240 (1.07), 2.252 (0.73), 2.327 (0.63), 2.522 (1.85), 2.669 (0.67), 3.484 (3.25), 3.654 (5.30), 3.666 (4.89), 4.223 (0.66), 4.244 (1.80), 4.251 (1.36), 4.265 (1.77), 4.272 (2.23), 4.282 (1.77), 4.297 (1.50), 4.316 (0.61), 5.240 (0.78), 5.254 (1.76), 5.273 (1.72), 5.287 (0.74), 5.754 (1.31), 6.794 (3.28), 6.814 (3.60), 6.920 (1.57), 6.937 (3.30), 6.955 (1.94), 7.160 (1.66), 7.163 (1.71), 7.181 (2.72), 7.198 (1.33), 7.392 (2.85), 7.409 (2.68), 7.635 (8.69), 7.639 (16.00), 7.647 (5.36), 7.652 (4.23), 7.707 (2.28), 7.725 (3.22), 7.746 (2.80), 7.872 (3.73), 7.887 (2.92), 8.399 (3.12), 8.417 (2.89), 8.770 (11.57), 9.239 (3.04), 9.260 (2.96).
204	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.83 min; MS (ESIpos): m/z = 508 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.150 (1.38), -0.008 (13.30), 0.008 (13.66), 0.146 (1.50), 1.235 (1.56), 2.049 (1.20), 2.076 (1.68), 2.206 (1.50), 2.217 (1.62), 2.226 (1.44), 2.322 (2.70), 2.327 (3.60), 2.331 (2.70), 2.366 (2.52), 2.522 (13.90), 2.664 (3.00), 2.669 (3.84), 2.674 (2.88), 2.709 (2.46), 3.218 (3.96), 3.241 (9.11), 3.262 (8.45), 3.273 (10.25), 3.285 (11.63), 3.858 (7.95), 3.870 (13.30), 3.881 (7.43), 4.223 (0.72), 4.243 (2.64), 4.251 (2.10), 4.264 (3.90), 4.273 (3.96), 4.289 (2.16), 4.381 (4.85), 4.403 (9.65), 4.425 (4.67), 5.240 (1.02), 5.255 (2.40), 5.275 (2.34), 5.288 (0.96), 5.753 (2.76), 6.784 (4.43), 6.802 (4.91), 6.871 (3.66), 6.890 (7.49), 6.909 (5.87), 6.923 (4.73), 6.942 (2.82), 7.109 (4.55), 7.127 (3.90), 7.151 (2.46), 7.168 (3.78), 7.186 (1.92), 7.237 (4.19), 7.256 (3.78), 7.363 (4.01), 7.382 (3.72), 7.618 (2.64), 7.636 (5.21), 7.657 (5.27), 7.674 (5.69), 7.678 (6.05), 7.692 (3.06), 7.696 (2.52), 8.202 (4.25), 8.206 (4.07), 8.223 (3.90), 8.227 (3.54), 8.583 (16.00), 9.155 (4.25), 9.176 (4.13).
205	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.94 min; m/z = 568/570 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d ₃) δ [ppm]: 8.83 (s, 1H), 8.20 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.67 - 7.63 (m, 1H), 7.56 (dd, J = 8.0, 1.5 Hz, 1H), 7.34 (td, J = 7.8, 2.5 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.23 - 7.12 (m, 2H), 6.94 - 6.80 (m, 3H), 5.39 - 5.31 (m, 1H), 4.38 - 4

[1877]

206	LC-MS (方法 L2): RI = 4.15 min; m/z = 568/570 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.85 (s, 1H), 8.17 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.64 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.43 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.30 - 7.17 (m, 4H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.0 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 5.40 - 5.33 (m, 1H)
207	LC-MS (方法 L2): RI = 3.41 min; m/z = 526/528 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.84 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 8.14 (dd, J = 9.1, 1.4 Hz, 1H), 7.62 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.55 (dd, J = 8.1, 1.5 Hz, 1H), 7.34 (td, J = 7.8, 2.2 Hz, 1H), 7.26 (d, 1H), 7.23 - 7.14 (m, 2H), 6.94 - 6.83 (m, 3H), 5.38 - 5.31 (m, 1H)
208	LC-MS (方法 L2): RI = 3.61 min; m/z = 526/528 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.83 (s, 1H), 8.09 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.32 - 7.15 (m, 4H), 6.97 - 6.82 (m, 3H), 5.33 (q, J = 5.2 Hz, 1H), 4.38 - 4.28 (m, 1H), 4.22 - 4.13 (m, 1H), 3.12 (s, 6H), 2.42 - 2.32 (m, 1H)
209	LC-MS (方法 L2): RI = 3.85 min; m/z = 552/554 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.78 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.57 - 7.50 (m, 2H), 7.32 - 7.17 (m, 5H), 6.94 - 6.77 (m, 3H), 5.40 - 5.33 (m, 1H), 4.38 - 4.30 (m, 1H), 4.22 - 4.14 (m, 1H), 3.91 - 3.80 (m, 4H), 3.44 - 3.31 (m, 4H), 2.44 - 2.33 (m, 1H), 2.25 -
210	LC-MS (方法 L2): RI = 4.13 min; m/z = 552/554 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.81 (s, 1H), 7.61 (dd, J = 8.1, 5.3 Hz, 1H), 7.47 - 7.36 (m, 3H), 7.32 - 7.18 (m, 3H), 6.93 (td, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.0 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 5.41 - 5.33 (m, 1H), 4.40 - 4.32 (m, 1H), 4.
211	LC-MS (方法 L2): RI = 4.39 min; m/z = 568/570 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.24 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.73 (s, 1H), 8.20 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.92 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.68 (s, 3H), 7.39 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.18 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 7.1
212	LC-MS (方法 L2): RI = 4.12 min; m/z = 568/570 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.22 (dd, J = 8.0, 5.3 Hz, 1H), 8.62 (d, J = 3.1 Hz, 1H), 8.22 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.77 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.73 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.46 (td, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 7.41 - 7.33 (m, 2H), 7.16 (t, J = 7.0 Hz, 1H), 6.91 (
213	LC-MS (方法 L2): RI = 3.75 min; m/z = 526/528 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.13 (dd, J = 8.1, 5.1 Hz, 1H), 8.54 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.22 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.74 - 7.69 (m, 2H), 7.45 (td, J = 7.8, 4.4 Hz, 1H), 7.41 - 7.31 (m, 2H), 7.20 - 7.12 (m, 1H), 6.90 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.2, 1.0
214	LC-MS (方法 L2): RI = 3.27 min; m/z = 548 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (dd, J = 8.1, 5.5 Hz, 1H), 8.54 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 7.67 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.49 - 7.34 (m, 3H), 7.33 - 7.26 (m, 1H), 7.16 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1
215	LC-MS (方法 L2): RI = 3.56 min; m/z = 548 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.21 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 7.68 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.63 - 7.55 (m, 3H), 7.49 - 7.37 (m, 2H), 7.21 - 7.14 (m, 1H), 6.97 - 6.90 (m, 1H), 6.83 - 6.77 (m, 1H), 5.31 - 5.23 (m, 1H), 4.33 - 4.20 (m, 2H), 3.87 - 3.78 (m

[1878]

216	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.94 min, MS (ESIpos): m/z = 565 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.326 (0.43), 3.568 (16.00), 3.897 (2.36), 3.910 (6.78), 3.954 (0.55), 4.259 (0.56), 5.263 (0.41), 6.778 (0.76), 6.798 (0.79), 6.909 (0.76), 6.928 (0.43), 7.141 (0.43), 7.162 (0.66), 7.359 (0.68), 7.379 (0.61), 7.754 (0.48), 7.771 (0.70), 7.792 (0.53), 7.952 (0.81), 7.970 (0.69), 8.151 (1.35), 8.356 (0.70), 8.378 (0.67), 8.396 (1.42), 8.590 (2.23), 8.803 (2.18), 9.184 (0.66), 9.205 (0.63).
217	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.04 min, m/z = 506 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.12 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 7.67 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.62 - 7.56 (m, 3H), 7.45 - 7.35 (m, 2H), 7.21 - 7.14 (m, 1H), 6.97 - 6.89 (m, 1H), 6.80 (dd, J = 8.2, 1.0 Hz, 1H), 5.30 - 5.21 (m, 1H), 4.33 - 4.20 (m, 2H), 2.
218	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.03 min, m/z = 506 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ 9.11 (dd, J = 7.9, 5.8 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.45 - 7.38 (m, 2H), 7.35 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.33 - 7.26 (m, 1H), 7.16 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.
219	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.28 min, MS (ESIpos): m/z = 476 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (600 MHz, 二氟甲烷 -d ₂) δ [ppm]: 2.505 (11.27), 3.076 (9.00), 3.332 (16.00), 4.248 (0.52), 4.262 (0.80), 5.254 (0.50), 6.784 (0.99), 6.797 (1.22), 6.915 (0.81), 6.927 (0.45), 7.055 (0.40), 7.071 (0.64), 7.148 (0.45), 7.161 (0.75), 7.343 (0.79), 7.356 (0.75), 7.625 (0.76), 7.643 (1.22), 8.223 (0.76), 8.237 (0.72), 8.548 (1.64), 9.091 (0.69), 9.104 (0.67), 10.063 (0.80).
220	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.86 min, MS (ESIpos): m/z = 498 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (3.32), 0.008 (3.21), 1.236 (0.84), 1.817 (10.47), 1.834 (9.96), 2.029 (1.50), 2.037 (1.62), 2.048 (1.70), 2.064 (2.32), 2.071 (2.04), 2.198 (1.99), 2.210 (1.96), 2.219 (1.89), 2.231 (1.34), 2.327 (0.87), 2.366 (0.64), 2.669 (0.92), 2.710 (0.59), 3.607 (1.18), 3.634 (0.65), 3.880 (16.00), 4.208 (0.97), 4.230 (2.88), 4.257 (4.12), 4.266 (3.48), 4.273 (2.88), 4.282 (2.93), 4.294 (1.13), 4.300 (1.21), 5.224 (1.35), 5.239 (3.07), 5.258 (3.05), 5.273 (1.35), 6.779 (5.76), 6.799 (6.47), 6.894 (2.26), 6.913 (4.68), 6.932 (2.70), 6.998 (2.00), 7.017 (4.09), 7.036 (2.35), 7.146 (3.37), 7.165 (5.23), 7.182 (3.02), 7.199 (4.41), 7.222 (3.20), 7.274 (2.47), 7.352 (5.14), 7.371 (4.90), 7.465 (0.67), 7.486 (0.43), 7.610 (3.69), 7.627 (5.66), 7.676 (4.79), 7.696 (5.53), 7.714 (3.21), 8.095 (0.41), 8.114 (0.45), 8.262 (5.39), 8.283 (5.12), 8.578 (14.71), 9.146 (2.67).
221	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.11 min, MS (ESIpos): m/z = 518 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.072 (1.74), 2.203 (1.62), 2.327 (1.90), 2.366 (1.16), 2.669 (2.05), 2.710 (1.47), 3.286 (11.07), 3.877 (14.20), 4.237 (2.72), 4.262 (3.40), 5.249 (2.54), 5.268 (2.69), 6.781 (4.77), 6.802 (5.41), 6.903 (2.42), 6.921 (5.14), 6.940 (2.97), 7.149 (2.63), 7.168 (3.98), 7.185 (2.05), 7.320 (3.24), 7.343 (6.52), 7.365 (7.89), 7.381 (3.79), 7.480 (3.06), 7.487 (4.62), 7.496 (3.43), 7.502 (4.47), 7.510 (2.88), 7.520 (3.15), 7.532 (2.66), 7.543 (2.57), 7.686 (2.75), 7.704 (4.93), 7.725 (4.83), 7.767 (5.66), 7.782 (3.55), 8.292 (4.37), 8.310 (4.10), 8.624 (16.00), 9.156 (4.28), 9.176 (4.41).
222	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.07 min, MS (ESIpos): m/z = 520 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.008 (1.64), 2.023 (0.54), 2.038 (1.00), 2.046 (1.02), 2.058 (1.08), 2.073 (1.49), 2.081 (1.28), 2.088 (0.94), 2.184 (0.70), 2.193 (1.09), 2.205 (1.44), 2.217 (1.35), 2.227 (1.31), 2.240 (0.90), 2.248 (0.69), 2.327 (0.51), 2.366 (0.43), 2.669 (0.49), 3.259 (1.78), 3.278 (5.13), 3.289 (11.26), 3.301 (15.43), 3.312 (16.00), 3.867 (7.04), 3.878 (11.75), 3.889 (6.69), 4.209 (0.69), 4.216 (0.81), 4.237 (2.18), 4.245 (1.75), 4.264 (2.74), 4.271 (2.61), 4.287 (2.00), 4.306 (0.79), 5.236 (0.95), 5.250 (2.07), 5.269 (2.07), 5.283 (0.94), 6.783 (3.72), 6.803 (4.15), 6.814 (0.48), 6.906 (1.85), 6.924 (3.92), 6.942 (2.32), 7.148 (1.95), 7.152 (2.07), 7.169 (3.35), 7.190 (2.50), 7.200 (1.81), 7.208 (1.77), 7.222 (1.73), 7.369 (3.48), 7.387 (3.23), 7.562 (0.70), 7.570 (0.83), 7.578 (0.92), 7.585 (1.40), 7.598 (1.38), 7.606 (1.34), 7.611 (1.38), 7.619 (0.86), 7.626 (0.75), 7.634 (0.68), 7.707 (2.41), 7.725 (3.96), 7.746 (3.74), 7.799 (4.59), 7.814 (2.97), 8.265 (0.81), 8.314 (3.61), 8.317 (3.68), 8.335 (3.42), 8.338 (3.29), 8.650 (12.72), 8.724 (0.73), 9.169 (3.62), 9.189 (3.54).

[1879]

223	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.70 min; MS (ESIpos): m/z = 518 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.175 (0.49), 1.863 (1.82), 1.911 (2.02), 2.036 (3.68), 2.085 (1.72), 2.163 (2.23), 2.198 (1.58), 2.327 (1.01), 2.669 (1.08), 2.709 (0.62), 3.163 (3.07), 3.174 (3.15), 3.529 (1.52), 3.655 (0.88), 3.763 (1.37), 3.882 (2.44), 4.089 (0.62), 4.170 (3.56), 4.256 (6.88), 4.379 (3.32), 5.049 (3.25), 5.211 (2.58), 5.753 (9.32), 6.777 (6.14), 6.796 (6.47), 6.881 (3.02), 6.900 (6.29), 6.918 (4.00), 7.140 (3.30), 7.158 (5.04), 7.175 (2.77), 7.293 (5.66), 7.311 (5.73), 7.328 (2.80), 7.349 (2.01), 7.502 (5.11), 7.651 (2.66), 8.133 (16.00), 8.321 (3.22), 8.355 (6.29), 8.737 (1.30), 9.047 (1.75), 12.596 (0.49).
224	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.79 min; MS (ESIpos): m/z = 523 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.93), 0.146 (0.80), 2.056 (2.10), 2.203 (2.12), 2.327 (1.92), 2.366 (1.27), 2.670 (2.02), 2.709 (1.14), 3.893 (16.00), 4.229 (3.13), 4.249 (4.61), 4.256 (4.76), 4.495 (1.40), 5.241 (2.87), 5.258 (2.80), 6.770 (4.84), 6.790 (5.39), 6.878 (2.36), 6.896 (5.10), 6.914 (3.06), 7.134 (2.59), 7.152 (4.45), 7.171 (2.20), 7.333 (4.66), 7.352 (4.38), 7.507 (4.66), 7.525 (7.95), 7.550 (6.37), 7.569 (7.48), 7.588 (3.21), 7.691 (2.72), 7.709 (5.02), 7.730 (4.14), 7.788 (5.95), 7.804 (4.06), 8.195 (5.05), 8.214 (4.89), 8.287 (4.58), 8.308 (4.38), 8.483 (13.31), 9.143 (4.43), 9.164 (4.50), 9.188 (10.17).
225	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.04 min; MS (ESIpos): m/z = 498 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.049 (0.55), 2.058 (0.60), 2.069 (0.65), 2.084 (0.92), 2.092 (0.81), 2.200 (0.60), 2.210 (0.84), 2.222 (0.83), 2.231 (0.80), 2.244 (0.52), 2.387 (16.00), 2.670 (0.42), 3.246 (0.74), 3.266 (2.20), 3.278 (5.05), 3.290 (5.63), 3.652 (0.65), 3.863 (4.10), 3.874 (7.04), 3.885 (4.04), 4.225 (0.44), 4.246 (1.32), 4.253 (1.09), 4.267 (1.92), 4.276 (1.85), 4.293 (1.21), 4.312 (0.44), 5.246 (0.55), 5.260 (1.28), 5.279 (1.30), 5.293 (0.57), 5.754 (0.74), 6.788 (2.36), 6.809 (2.64), 6.915 (1.17), 6.933 (2.52), 6.952 (1.46), 7.048 (1.44), 7.072 (1.45), 7.156 (1.29), 7.175 (2.10), 7.191 (2.25), 7.222 (4.45), 7.376 (2.26), 7.395 (2.06), 7.659 (1.34), 7.678 (2.39), 7.698 (2.06), 7.758 (2.87), 7.776 (1.90), 8.243 (2.30), 8.264 (2.08), 8.668 (7.28), 9.157 (2.21), 9.178 (2.16).
226	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.10 min; MS (ESIpos): m/z = 518 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 3.279 (0.79), 3.291 (1.79), 3.312 (16.00), 3.868 (1.47), 3.879 (2.45), 3.889 (1.39), 4.237 (0.46), 4.258 (0.61), 4.286 (0.43), 5.249 (0.45), 5.268 (0.45), 5.754 (0.77), 6.781 (0.85), 6.801 (0.94), 6.904 (0.42), 6.922 (0.86), 6.941 (0.50), 7.149 (0.43), 7.167 (0.75), 7.304 (0.41), 7.324 (1.03), 7.344 (0.75), 7.366 (0.78), 7.385 (1.17), 7.400 (0.72), 7.644 (0.68), 7.695 (0.42), 7.713 (0.86), 7.734 (0.84), 7.754 (1.05), 7.769 (0.52), 8.300 (0.71), 8.318 (0.70), 8.629 (2.54), 9.157 (0.74), 9.177 (0.72).
227	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.02 min; MS (ESIpos): m/z = 518 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.030 (1.38), 2.038 (1.48), 2.053 (1.64), 2.064 (2.14), 2.072 (1.92), 2.187 (1.53), 2.199 (1.97), 2.210 (1.94), 2.220 (1.83), 2.233 (1.30), 2.669 (0.41), 3.254 (2.20), 3.287 (11.31), 3.876 (16.00), 4.213 (1.15), 4.234 (3.07), 4.241 (2.68), 4.255 (4.56), 4.264 (4.46), 4.281 (2.83), 4.300 (1.09), 5.229 (1.31), 5.244 (2.94), 5.262 (2.90), 5.277 (1.27), 5.753 (3.72), 6.777 (4.98), 6.798 (5.63), 6.896 (2.63), 6.914 (5.47), 6.933 (3.20), 7.144 (2.90), 7.163 (4.73), 7.182 (2.38), 7.244 (2.61), 7.265 (2.55), 7.289 (2.22), 7.297 (1.96), 7.311 (3.96), 7.318 (3.43), 7.332 (2.42), 7.340 (2.20), 7.355 (5.09), 7.374 (4.69), 7.573 (3.19), 7.586 (3.35), 7.595 (3.06), 7.608 (2.68), 7.666 (2.45), 7.683 (11.68), 7.703 (5.74), 7.721 (2.06), 8.279 (4.22), 8.283 (4.22), 8.299 (3.93), 8.303 (3.83), 8.588 (13.90), 9.158 (4.80), 9.178 (4.64).

[1880]

228	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.11 min; MS (ESIpos): m/z = 530 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.050 (0.48), 2.057 (0.51), 2.071 (0.57), 2.085 (0.76), 2.092 (0.66), 2.199 (0.53), 2.210 (0.69), 2.221 (0.68), 2.231 (0.64), 2.244 (0.44), 3.245 (0.65), 3.265 (1.89), 3.276 (4.16), 3.288 (4.44), 3.822 (16.00), 3.844 (0.52), 3.864 (3.56), 3.874 (5.85), 3.884 (3.40), 4.246 (1.08), 4.263 (0.91), 4.267 (1.58), 4.276 (1.53), 4.293 (0.98), 5.244 (0.47), 5.258 (1.07), 5.277 (1.07), 5.291 (0.47), 5.754 (1.95), 6.788 (1.90), 6.809 (2.13), 6.916 (0.97), 6.935 (2.06), 6.954 (1.21), 7.062 (2.64), 7.094 (2.80), 7.156 (1.06), 7.175 (1.70), 7.197 (3.47), 7.378 (1.82), 7.397 (1.68), 7.662 (1.05), 7.682 (1.95), 7.701 (1.50), 7.782 (2.37), 7.799 (1.71), 8.251 (1.97), 8.272 (1.79), 8.677 (5.49), 9.160 (1.84), 9.180 (1.81).
229	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.76 min; MS (ESIpos): m/z = 443 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.69), -0.008 (5.65), 0.008 (5.56), 0.146 (0.66), 1.997 (0.61), 2.012 (1.19), 2.023 (1.58), 2.031 (1.41), 2.044 (2.52), 2.059 (2.38), 2.072 (0.97), 2.127 (0.89), 2.141 (2.46), 2.155 (2.88), 2.169 (1.49), 2.191 (1.36), 2.203 (0.61), 2.327 (1.22), 2.366 (1.05), 2.523 (3.99), 2.669 (1.30), 2.709 (1.13), 3.057 (15.92), 3.069 (16.00), 4.247 (5.37), 4.259 (8.78), 4.273 (5.09), 5.218 (1.36), 5.233 (3.02), 5.253 (3.02), 5.267 (1.38), 6.780 (5.48), 6.800 (6.06), 6.889 (2.85), 6.891 (2.82), 6.908 (6.03), 6.926 (3.63), 7.139 (2.88), 7.143 (3.02), 7.160 (4.73), 7.178 (2.35), 7.182 (2.30), 7.304 (5.04), 7.322 (4.71), 7.414 (1.99), 7.434 (5.79), 7.446 (4.98), 7.464 (7.53), 7.484 (3.74), 7.508 (4.98), 7.511 (9.38), 7.515 (6.42), 7.530 (7.11), 7.553 (3.24), 7.632 (8.14), 7.636 (4.76), 7.667 (5.87), 7.684 (4.76), 7.756 (1.49), 8.133 (6.12), 8.233 (1.00), 8.312 (4.40), 8.333 (4.21), 8.424 (15.67), 8.963 (3.43), 8.983 (3.35), 12.706 (0.72).
230	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.93 min; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.039 (0.49), 2.074 (0.74), 2.206 (0.68), 2.217 (0.65), 2.228 (0.62), 3.247 (0.58), 3.279 (4.26), 3.291 (4.54), 3.861 (3.48), 3.872 (5.83), 3.883 (3.38), 3.919 (16.00), 4.240 (1.05), 4.247 (0.85), 4.261 (1.44), 4.288 (0.95), 5.239 (0.43), 5.254 (1.04), 5.273 (1.05), 5.287 (0.48), 5.754 (5.28), 6.783 (2.11), 6.803 (2.33), 6.907 (0.98), 6.926 (2.11), 6.945 (1.22), 7.152 (1.05), 7.172 (2.27), 7.192 (1.76), 7.202 (1.25), 7.220 (1.17), 7.288 (1.26), 7.305 (1.27), 7.318 (1.25), 7.334 (1.22), 7.367 (1.77), 7.386 (1.63), 7.661 (0.93), 7.680 (2.04), 7.700 (1.95), 7.722 (2.44), 7.738 (1.14), 8.258 (1.70), 8.276 (1.55), 8.620 (6.28), 9.153 (1.82), 9.173 (1.77).
231	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.25 min; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.072 (0.90), 2.204 (0.83), 2.327 (0.69), 2.366 (0.42), 2.408 (16.00), 2.670 (0.67), 3.282 (5.02), 3.294 (5.70), 3.862 (3.95), 3.873 (6.80), 3.885 (3.85), 4.237 (1.27), 4.259 (1.58), 4.285 (1.15), 5.249 (1.24), 5.268 (1.26), 6.783 (2.54), 6.803 (2.69), 6.906 (1.22), 6.924 (2.41), 6.941 (1.48), 7.147 (1.32), 7.169 (1.98), 7.186 (1.00), 7.326 (2.64), 7.352 (2.75), 7.365 (2.13), 7.381 (1.93), 7.448 (3.44), 7.465 (3.40), 7.674 (1.50), 7.692 (2.59), 7.713 (2.56), 7.743 (2.91), 7.757 (1.61), 8.273 (2.14), 8.277 (2.20), 8.294 (2.00), 8.612 (8.94), 9.154 (2.17), 9.175 (2.13).
232	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.90 min; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.033 (0.68), 2.041 (0.74), 2.052 (0.79), 2.068 (1.07), 2.075 (0.94), 2.189 (0.70), 2.201 (0.97), 2.213 (0.96), 2.222 (0.91), 2.235 (0.63), 2.327 (0.60), 2.366 (0.45), 2.669 (0.68), 2.709 (0.48), 3.254 (0.88), 3.273 (2.55), 3.286 (5.77), 3.588 (15.32), 3.591 (16.00), 3.864 (4.82), 3.875 (8.30), 3.886 (4.64), 4.213 (0.57), 4.234 (1.64), 4.241 (1.30), 4.261 (2.03), 4.269 (1.72), 4.276 (1.38), 4.285 (1.39), 4.304 (0.57), 5.232 (0.65), 5.246 (1.48), 5.265 (1.51), 5.279 (0.66), 6.782 (2.77), 6.802 (3.06), 6.901 (1.38), 6.919 (2.88), 6.936 (1.69), 7.032 (0.93), 7.037 (0.97), 7.048 (1.14), 7.053 (2.04), 7.059 (1.39), 7.069 (1.33), 7.075 (1.25), 7.145 (1.39), 7.149 (1.51), 7.167 (2.40), 7.184 (2.10), 7.204 (1.50), 7.227 (1.53), 7.249 (0.88), 7.354 (2.50), 7.372 (2.32), 7.637 (0.62), 7.643 (1.31), 7.655 (4.76), 7.659 (6.97), 7.678 (3.56), 7.695 (1.24), 8.249 (2.35), 8.255 (2.38), 8.269 (2.16), 8.274 (2.15), 8.597 (9.66), 9.143 (2.61), 9.163 (2.55).

[1881]

233	LC-MS (方法 L2): Rt = 4.22 min, m/z = 602 (C12 模式) (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ (ppm): 9.20 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.46 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.70 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.40 – 7.30 (m, 3H), 7.20 – 7.13 (m, 1H), 6.95 – 6.88 (m, 1H), 6.82 – 6.76 (m, 1H), 5.28 – 5.20 (m, 1H), 4.32
234	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.10 min; MS (ESIpos): m/z = 502 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ (ppm): -0.149 (0.59), -0.008 (5.31), 0.008 (4.81), 0.146 (0.56), 2.049 (1.06), 2.057 (1.15), 2.069 (1.17), 2.084 (1.68), 2.091 (1.48), 2.198 (1.12), 2.211 (1.57), 2.223 (1.45), 2.233 (1.45), 2.246 (0.95), 2.327 (1.17), 2.366 (1.12), 2.523 (3.97), 2.669 (1.34), 2.710 (1.17), 3.249 (1.26), 3.268 (4.20), 3.280 (9.93), 3.291 (10.83), 3.651 (1.90), 3.865 (7.83), 3.876 (13.26), 3.887 (7.52), 4.225 (0.87), 4.245 (2.52), 4.253 (1.99), 4.267 (3.33), 4.293 (2.21), 4.312 (0.81), 5.245 (1.03), 5.259 (2.35), 5.279 (2.38), 5.293 (1.06), 6.788 (4.36), 6.809 (4.90), 6.917 (2.18), 6.933 (4.64), 6.951 (2.80), 7.154 (2.49), 7.157 (2.57), 7.175 (4.00), 7.193 (1.99), 7.247 (1.76), 7.253 (1.29), 7.265 (1.59), 7.271 (3.41), 7.277 (2.49), 7.294 (1.87), 7.300 (1.45), 7.319 (4.84), 7.324 (5.48), 7.340 (6.01), 7.356 (1.23), 7.377 (4.17), 7.396 (3.86), 7.681 (3.13), 7.700 (4.62), 7.720 (4.20), 7.827 (4.95), 7.831 (5.20), 7.845 (4.06), 7.848 (3.92), 8.273 (4.31), 8.276 (4.39), 8.295 (4.11), 8.693 (16.00), 9.165 (4.20), 9.185 (4.11).
235	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.29 min; MS (ESIpos): m/z = 568 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ (ppm): 2.091 (2.67), 2.220 (2.73), 2.327 (2.60), 2.367 (5.33), 2.668 (4.62), 2.710 (5.79), 3.882 (16.00), 4.244 (3.32), 4.266 (4.62), 5.255 (3.12), 6.789 (4.36), 6.809 (4.81), 6.915 (2.34), 6.934 (4.75), 6.952 (2.73), 7.155 (2.80), 7.174 (4.29), 7.195 (2.15), 7.381 (4.62), 7.399 (4.16), 7.706 (2.47), 7.724 (4.62), 7.743 (2.99), 7.896 (7.28), 7.903 (12.75), 7.985 (7.15), 8.302 (4.75), 8.323 (4.36), 8.693 (9.95), 9.174 (4.29), 9.194 (4.10).
236	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.38 min; MS (ESIpos): m/z = 462 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ (ppm): -0.008 (2.92), 0.008 (2.76), 1.236 (1.50), 1.259 (1.23), 1.299 (0.85), 1.983 (0.59), 1.996 (1.10), 2.008 (1.36), 2.016 (1.23), 2.030 (2.09), 2.044 (1.95), 2.057 (0.80), 2.118 (0.75), 2.132 (2.09), 2.146 (2.34), 2.161 (1.32), 2.181 (1.28), 2.195 (0.53), 2.300 (1.82), 2.327 (0.64), 2.366 (0.61), 2.523 (2.31), 2.669 (0.73), 2.709 (0.69), 3.057 (12.33), 3.070 (12.39), 3.341 (0.78), 3.370 (0.41), 3.382 (0.48), 3.874 (0.57), 4.237 (4.47), 4.249 (7.39), 4.264 (4.32), 4.482 (1.02), 4.497 (1.07), 4.858 (10.93), 5.146 (0.64), 5.206 (1.12), 5.221 (2.49), 5.240 (2.47), 5.255 (1.12), 5.359 (0.43), 6.772 (4.55), 6.793 (4.96), 6.878 (2.39), 6.880 (2.39), 6.896 (4.95), 6.899 (4.90), 6.915 (2.97), 6.917 (2.87), 7.132 (2.42), 7.135 (2.57), 7.153 (4.02), 7.170 (2.01), 7.174 (1.96), 7.232 (0.48), 7.250 (0.41), 7.274 (1.85), 7.293 (8.65), 7.312 (7.85), 7.327 (1.21), 7.333 (1.21), 7.345 (3.29), 7.355 (13.29), 7.365 (4.96), 7.376 (1.77), 7.527 (1.53), 7.545 (2.97), 7.566 (2.27), 7.591 (1.64), 7.608 (2.84), 7.629 (4.71), 7.647 (2.65), 7.765 (1.79), 8.133 (0.54), 8.367 (16.00), 8.391 (3.06), 8.958 (2.52), 8.979 (2.52), 10.023 (0.51), 11.746 (5.38).
237	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.57 min; MS (ESIpos): m/z = 512 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ (ppm): -0.150 (0.77), 0.146 (0.83), 0.853 (0.66), 1.235 (5.81), 1.259 (3.13), 1.298 (2.19), 1.985 (1.63), 1.998 (1.98), 2.019 (2.99), 2.035 (2.68), 2.126 (2.85), 2.140 (3.27), 2.159 (2.19), 2.175 (1.95), 2.327 (1.98), 2.366 (1.29), 2.669 (2.37), 2.710 (1.57), 3.051 (15.79), 3.061 (16.00), 3.370 (1.57), 3.382 (1.70), 3.395 (1.15), 3.413 (0.73), 3.508 (0.97), 3.520 (1.18), 3.534 (0.94), 3.561 (1.11), 3.574 (1.22), 4.233 (6.02), 4.245 (10.37), 4.259 (6.33), 4.482 (2.37), 4.496 (2.33), 4.858 (9.39), 5.131 (0.66), 5.146 (1.29), 5.160 (0.63), 5.198 (1.74), 5.213 (3.69), 5.233 (3.76), 5.247 (1.77), 5.359 (1.22), 6.768 (7.10), 6.788 (7.93), 6.874 (3.27), 6.893 (7.03), 6.911 (4.24), 7.132 (3.58), 7.150 (5.95), 7.171 (2.85), 7.219 (0.56), 7.266 (6.26), 7.307 (11.55), 7.320 (3.51), 7.355 (11.93), 7.365 (3.90), 7.393 (4.45), 7.398 (4.56), 7.418 (4.73), 7.424 (4.42), 7.460 (0.94), 7.518 (4.42), 7.536 (7.55), 7.556 (7.23), 7.585 (8.59), 7.601 (5.11), 7.614 (3.20), 7.634 (2.19), 7.706 (1.01), 7.724 (1.50), 7.774 (2.57), 7.871 (11.10), 7.877 (10.96), 7.910 (2.57), 7.927 (2.23), 7.954 (0.59), 8.022 (0.70), 8.139 (1.18), 8.340 (15.06), 8.374 (5.91), 8.394 (5.57), 8.427 (0.73), 8.946 (4.28), 8.967 (4.28), 10.022 (3.72), 11.746 (4.21).

[1882]

238	LC-MS (方法 L1): RT = 1.05 min; MS (ESipos): m/z = 518 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (0.56), 0.008 (0.52), 2.523 (0.53), 3.277 (0.80), 3.290 (1.68), 3.310 (16.00), 3.333 (0.41), 3.867 (1.46), 3.877 (2.48), 3.889 (1.37), 4.232 (0.50), 4.253 (0.68), 4.264 (0.64), 4.271 (0.44), 4.280 (0.43), 5.241 (0.43), 5.260 (0.43), 6.777 (0.84), 6.798 (0.93), 6.912 (0.84), 6.930 (0.49), 7.141 (0.44), 7.145 (0.46), 7.162 (0.73), 7.354 (0.77), 7.371 (0.72), 7.447 (0.89), 7.456 (1.29), 7.468 (0.84), 7.475 (0.99), 7.668 (0.48), 7.680 (1.31), 7.685 (1.24), 7.690 (1.31), 7.709 (1.11), 7.727 (0.46), 8.286 (0.80), 8.291 (0.82), 8.306 (0.74), 8.311 (0.72), 8.589 (2.41), 9.154 (0.41).
239	LC-MS (方法 L1): RT = 1.18 min; MS (ESipos): m/z = 532 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.278 (3.88), 3.284 (1.78), 3.297 (2.06), 3.310 (16.00), 3.875 (2.72), 4.236 (0.51), 4.258 (0.65), 4.285 (0.46), 5.248 (0.49), 5.267 (0.50), 6.782 (0.98), 6.801 (1.08), 6.902 (0.49), 6.921 (0.99), 6.939 (0.59), 7.150 (0.51), 7.168 (0.80), 7.186 (0.41), 7.264 (0.62), 7.271 (0.72), 7.279 (0.66), 7.286 (0.65), 7.367 (0.86), 7.385 (0.82), 7.442 (0.63), 7.452 (0.65), 7.673 (0.52), 7.691 (1.06), 7.711 (1.07), 7.732 (1.23), 7.746 (0.57), 8.279 (0.87), 8.299 (0.80), 8.624 (3.45), 9.154 (0.86), 9.175 (0.85).
240	LC-MS (方法 L1): RT = 1.19 min; MS (ESipos): m/z = 532 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (0.50), 0.008 (0.44), 2.345 (4.63), 3.275 (0.72), 3.287 (1.65), 3.299 (1.87), 3.310 (16.00), 3.865 (1.37), 3.876 (2.36), 3.888 (1.31), 4.237 (0.45), 4.259 (0.60), 4.269 (0.56), 5.249 (0.43), 5.268 (0.43), 6.782 (0.83), 6.803 (0.90), 6.924 (0.83), 6.941 (0.49), 7.147 (0.41), 7.150 (0.43), 7.167 (0.71), 7.184 (0.80), 7.192 (0.61), 7.198 (0.56), 7.367 (0.70), 7.385 (0.66), 7.447 (0.53), 7.451 (0.52), 7.463 (0.55), 7.682 (0.43), 7.700 (0.93), 7.720 (1.01), 7.731 (1.02), 7.735 (1.15), 7.748 (0.49), 8.284 (0.71), 8.288 (0.72), 8.305 (0.69), 8.309 (0.65), 8.626 (3.04), 9.154 (0.75), 9.175 (0.74).
241	LC-MS (方法 L1): RT = 1.38 min; MS (ESipos): m/z = 602 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.219 (16.00), 1.414 (0.57), 1.908 (0.65), 1.924 (0.64), 1.941 (0.52), 1.959 (0.45), 2.501 (12.69), 2.889 (0.42), 3.164 (0.96), 3.174 (0.90), 5.530 (0.45), 5.549 (0.44), 7.233 (0.64), 7.241 (0.67), 7.250 (1.06), 7.271 (0.78), 7.448 (0.44), 7.456 (0.48), 7.469 (0.40), 7.639 (5.38), 7.652 (0.69), 7.672 (0.56), 7.809 (0.75), 7.826 (0.60), 8.314 (0.64), 8.335 (0.58), 8.687 (2.17), 9.077 (0.63), 9.097 (0.60).
242	LC-MS (方法 L6): RT = 1.39 min; MS (ESipos): m/z = 618 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.198 (16.00), 1.918 (0.63), 1.932 (0.85), 1.945 (0.51), 4.260 (0.44), 6.788 (0.61), 6.808 (0.69), 6.939 (0.64), 7.186 (0.52), 7.394 (0.55), 7.412 (0.51), 7.638 (5.73), 7.655 (0.62), 7.676 (0.53), 7.815 (0.70), 7.832 (0.56), 8.315 (0.60), 8.334 (0.55), 8.684 (2.06), 9.236 (0.58), 9.257 (0.57).
243	LC-MS (方法 L6): RT = 2.63 min; MS (ESipos): m/z = 618 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (0.59), 0.008 (0.57), 1.194 (16.00), 1.209 (0.55), 2.041 (0.61), 2.056 (0.60), 2.067 (0.49), 2.086 (0.43), 4.279 (0.48), 4.293 (0.85), 4.305 (0.52), 6.785 (0.57), 6.804 (0.64), 6.881 (0.61), 7.163 (0.49), 7.292 (0.52), 7.310 (0.49), 7.643 (3.60), 7.659 (0.61), 7.680 (0.50), 7.819 (0.64), 7.834 (0.53), 8.352 (0.56), 8.371 (0.52), 8.689 (2.03), 9.172 (0.56), 9.192 (0.54).

[1883]

244	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.27 min; MS (ESipos): m/z = 498 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.63), 0.008 (2.13), 1.862 (1.03), 1.885 (0.89), 1.888 (0.91), 2.002 (0.76), 2.023 (1.37), 2.034 (1.59), 2.054 (1.51), 2.156 (0.85), 2.170 (1.04), 2.185 (0.86), 2.201 (0.61), 2.311 (0.43), 2.327 (0.46), 2.376 (16.00), 2.392 (2.37), 2.669 (0.43), 3.033 (0.41), 3.192 (0.48), 3.205 (0.71), 3.213 (0.64), 3.228 (0.83), 3.305 (2.36), 3.461 (0.98), 3.488 (1.75), 3.516 (0.92), 3.691 (0.53), 3.707 (1.16), 3.728 (0.79), 3.788 (0.70), 3.805 (0.71), 3.821 (0.86), 3.831 (1.06), 3.844 (1.78), 3.857 (1.54), 3.871 (1.20), 3.883 (0.74), 4.163 (3.03), 4.258 (2.73), 4.266 (3.03), 4.279 (1.47), 4.374 (1.56), 5.215 (0.85), 5.227 (1.09), 5.247 (0.91), 5.260 (0.41), 6.780 (2.43), 6.789 (2.76), 6.891 (1.22), 6.910 (2.68), 6.928 (1.78), 7.014 (1.49), 7.038 (1.51), 7.144 (1.33), 7.162 (2.39), 7.179 (2.31), 7.205 (5.13), 7.253 (0.67), 7.305 (2.22), 7.324 (2.00), 7.450 (1.52), 7.469 (2.29), 7.489 (1.84), 7.638 (2.80), 7.653 (2.35), 8.144 (10.55), 8.227 (2.36), 8.248 (2.20), 8.418 (4.54), 8.423 (4.98), 8.786 (1.00), 9.041 (1.92), 9.061 (1.88).
245	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.24 min; MS (ESipos): m/z = 532 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.77), -0.008 (6.72), 0.008 (6.90), 0.146 (0.79), 1.055 (0.79), 1.862 (1.68), 1.885 (1.70), 1.895 (1.97), 2.006 (1.70), 2.027 (2.95), 2.040 (3.20), 2.060 (1.95), 2.072 (1.32), 2.085 (1.63), 2.145 (1.45), 2.159 (1.57), 2.175 (1.52), 2.327 (1.52), 2.365 (1.04), 2.669 (1.41), 2.709 (0.77), 2.976 (0.89), 3.005 (1.41), 3.073 (1.32), 3.083 (1.34), 3.113 (0.93), 3.164 (2.00), 3.177 (2.34), 3.187 (2.36), 3.200 (2.22), 3.304 (2.68), 3.466 (1.97), 3.496 (2.86), 3.524 (1.75), 3.695 (1.16), 3.719 (1.95), 3.737 (1.34), 3.788 (0.68), 3.810 (1.16), 3.828 (1.48), 3.848 (2.50), 3.864 (2.18), 3.874 (3.20), 3.889 (1.95), 3.900 (1.23), 3.937 (0.43), 4.163 (11.73), 4.255 (5.47), 4.374 (2.88), 5.226 (1.84), 5.266 (0.59), 6.772 (4.31), 6.791 (5.17), 6.809 (1.38), 6.879 (2.04), 6.899 (4.70), 6.916 (3.56), 6.935 (0.70), 7.016 (1.41), 7.032 (2.79), 7.048 (1.86), 7.084 (0.86), 7.105 (0.68), 7.137 (2.31), 7.156 (4.45), 7.177 (3.63), 7.204 (2.20), 7.225 (1.41), 7.242 (0.68), 7.287 (3.50), 7.306 (3.22), 7.342 (0.93), 7.359 (0.98), 7.448 (2.31), 7.466 (3.93), 7.487 (3.79), 7.526 (5.13), 7.541 (3.06), 7.688 (1.57), 7.696 (1.68), 7.705 (3.70), 8.204 (16.00), 8.276 (4.47), 8.297 (3.47), 8.360 (10.80), 8.716 (4.06), 9.014 (1.95), 9.027 (2.34), 9.035 (2.07), 9.047 (1.97), 9.155 (0.86), 9.176 (0.79).
246	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.21 min; MS (ESipos): m/z = 532 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (1.15), 0.008 (1.23), 1.862 (0.77), 1.876 (0.55), 1.888 (0.61), 1.900 (0.68), 1.908 (0.60), 1.997 (0.55), 2.020 (0.91), 2.030 (1.23), 2.039 (0.99), 2.049 (0.99), 2.061 (0.58), 2.150 (0.56), 2.165 (0.68), 2.180 (0.59), 2.195 (0.42), 2.523 (0.68), 3.169 (1.12), 3.207 (0.44), 3.230 (0.51), 3.305 (0.99), 3.471 (0.58), 3.498 (1.19), 3.525 (0.73), 3.655 (0.44), 3.699 (0.41), 3.723 (0.82), 3.736 (0.56), 3.743 (0.59), 3.803 (0.57), 3.820 (0.55), 3.828 (0.57), 3.835 (0.56), 3.846 (1.52), 3.858 (1.38), 3.873 (0.89), 3.885 (1.01), 3.896 (0.64), 3.911 (16.00), 3.924 (2.42), 4.160 (2.23), 4.247 (1.69), 4.253 (2.01), 4.259 (1.98), 4.374 (1.08), 5.210 (0.63), 5.219 (0.73), 5.231 (0.77), 5.240 (0.56), 6.776 (1.78), 6.794 (1.90), 6.796 (1.93), 6.886 (0.87), 6.904 (1.89), 6.923 (1.25), 7.140 (1.08), 7.148 (1.24), 7.158 (1.75), 7.166 (1.29), 7.175 (1.95), 7.194 (1.17), 7.263 (1.08), 7.280 (1.12), 7.294 (2.16), 7.311 (1.67), 7.451 (1.14), 7.469 (1.65), 7.490 (1.47), 7.599 (1.95), 7.615 (1.51), 8.140 (6.92), 8.264 (1.70), 8.276 (0.41), 8.286 (1.58), 8.370 (4.09), 8.372 (3.69), 8.738 (0.72), 9.025 (1.07), 9.032 (0.96), 9.046 (1.07), 9.053
247	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.82 min; MS (ESipos): m/z = 478 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (1.77), 0.008 (1.62), 1.754 (1.10), 3.086 (16.00), 4.249 (0.89), 4.257 (0.88), 5.230 (0.54), 6.777 (1.07), 6.797 (1.20), 6.890 (0.49), 6.908 (1.04), 6.926 (0.63), 7.143 (0.51), 7.160 (0.85), 7.178 (0.42), 7.339 (0.86), 7.357 (0.83), 7.586 (0.46), 7.600 (0.44), 7.669 (0.76), 7.686 (1.09), 7.708 (1.03), 7.788 (1.10), 7.803 (0.82), 8.233 (0.62), 8.303 (1.02), 8.321 (1.02), 8.550 (2.65), 9.066 (0.59), 9.088 (0.56).

[1884]

248	3.41	¹ H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 8.8586 (3.81); 8.8384 (3.7); 8.7959 (0.89); 8.6133 (1.6); 8.3145 (0.54); 8.2003 (5.17); 8.1796 (6.09); 8.1605 (0.57); 8.1408 (0.42); 8.1194 (0.37); 7.7297 (2.81); 7.7117 (6.49); 7.6916 (5.56); 7.674 (8.15); 7.6572 (3.78); 7.5658 (3.63); 7.5485 (5.05); 7.5233 (0.53); 7.4659 (2.08); 7.4474 (5.9); 7.4352 (6.58); 7.4201 (10.6); 7.401 (7.64); 7.3696 (4.28); 7.1855 (0.44); 7.1677 (2.86); 7.1479 (5.7); 7.1292 (3.51); 6.9273 (3.58); 6.9086 (6.16); 6.8902 (3.03); 6.7978 (0.51); 6.7802 (7.27); 6.76 (6.4); 5.3045 (0.38); 5.2303 (1.66); 5.215 (3.56); 5.1967 (3.61); 5.1821 (1.57); 4.2872 (1.16); 4.2678 (3.46); 4.2545 (6.45); 4.2294 (3.77); 4.209 (1.09); 4.0558 (0.79); 4.0381 (2.17); 4.0204 (2.21); 4.0027 (0.72); 3.7036 (0.64); 3.4987 (41.77); 3.4769 (2.9); 3.3203 (34.08); 3.2937 (39.4); 3.2522 (2.31); 2.6698 (1.63); 2.5008 (284.9); 2.3275 (1.72); 2.162 (2.06); 2.1511 (2.35); 2.1408 (2.37); 2.0491 (2.34); 2.0417 (2.67); 2.0242 (2.02); 2.0072 (1.6); 1.9885 (9.27); 1.2351 (0.38); 1.1928 (2.3); 1.175 (4.51); 1.1572 (2.22); -0.0001 (28.96); -0.0051 (8.21)
249	3.99	¹ H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 8.8722 (2.6); 8.8534 (4.17); 8.8356 (2.45); 8.6283 (1.6); 8.3151 (0.4); 8.2158 (4.05); 8.1962 (4.44); 7.7428 (2.44); 7.7248 (7.39); 7.7193 (7); 7.7157 (6.57); 7.7049 (13.43); 7.6994 (14.58); 7.6871 (2.66); 7.4723 (2.01); 7.4623 (2.04); 7.453 (4.25); 7.4429 (3.96); 7.4331 (2.87); 7.4227 (5.23); 7.3996 (4.11); 7.3619 (3.39); 7.3461 (5.37); 7.3279 (2.31); 7.1671 (2.41); 7.1484 (5.12); 7.1288 (3.22); 6.9268 (2.74); 6.9082 (4.77); 6.8896 (2.27); 6.7797 (6.81); 6.7595 (6.15); 5.2265 (1.31); 5.2117 (3.11); 5.1938 (3.02); 5.1779 (1.3); 4.2866 (1.01); 4.2674 (3.19); 4.2527 (5.74); 4.245 (5.26); 4.2269 (3.27); 4.2067 (0.94); 4.0557 (0.4); 4.0377 (1.21); 4.0198 (1.19); 4.0022 (0.41); 3.4991 (33.03); 3.3194 (26.59); 3.2941 (42.87); 2.6699 (1.31); 2.6325 (1.42); 2.5047 (173.21); 2.5007 (220.51); 2.4988 (169.05); 2.3277 (1.28); 2.1552 (1.78); 2.1467 (1.98); 2.1354 (1.9); 2.0536 (1.58); 2.0461 (2.06); 2.0382 (2.41); 2.0293 (1.73); 2.0221 (1.72); 2.0124 (1.48); 2.0033 (1.41); 1.9882 (5.54); 1.3973 (0.39); 1.1925 (1.29); 1.1746 (2.48); 1.1569 (1.25); -0.0002 (29.01)
250	4.87	¹ H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 8.8638 (2.16); 8.8431 (2.2); 8.7403 (8.57); 8.3148 (0.35); 8.2096 (2.24); 8.2067 (2.37); 8.1883 (2.63); 8.1855 (2.59); 7.8776 (2.13); 7.8749 (2.29); 7.8598 (2.88); 7.8571 (2.85); 7.7436 (2.21); 7.7227 (2.59); 7.7045 (1.68); 7.6508 (1.6); 7.4465 (2.08); 7.4284 (2.26); 7.181 (0.97); 7.1773 (1.02); 7.16 (2.16); 7.1425 (1.33); 7.1389 (1.31); 6.9459 (1.54); 6.9275 (2.62); 6.9086 (1.24); 6.7901 (2.91); 6.7708 (2.62); 5.246 (0.57); 5.2307 (1.34); 5.2111 (1.31); 5.1962 (0.59); 4.2989 (0.4); 4.2923 (0.34); 4.2803 (1.25); 4.2648 (2.35); 4.2564 (2.18); 4.2462 (1.28); 4.238 (1.35); 4.2183 (0.41); 3.4928 (21.15); 3.3195 (28.27); 3.2832 (18.37); 2.6707 (0.76); 2.5055 (99.44); 2.5013 (134.25); 2.4971 (103.62); 2.3283 (0.8); 2.1902 (0.48); 2.1778 (0.73); 2.169 (0.84); 2.1575 (0.88); 2.1451 (0.68); 2.0765 (0.62); 2.0678 (0.83); 2.0606 (0.98); 2.0512 (0.71); 2.0439 (0.7); 2.034 (0.6); 2.0254 (0.58); 1.3977 (0.96); -0.0002 (18.38)
251		¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ (ppm): 0.832 (0.78); 0.872 (0.63); 1.225 (1.56); 1.239 (2.99); 1.254 (2.68); 1.285 (0.49); 2.012 (5.28); 2.125 (0.61); 2.136 (1.21); 2.143 (1.50); 2.153 (1.46); 2.162 (2.19); 2.172 (2.02); 2.181 (0.79); 2.253 (0.83); 2.265 (1.86); 2.277 (2.20); 2.290 (1.59); 2.306 (1.15); 2.317 (0.53); 3.149 (1.15); 3.179 (10.27); 3.371 (1.35); 3.379 (2.47); 3.394 (3.63); 3.403 (5.57); 3.412 (3.40); 3.423 (3.54); 3.431 (5.99); 3.440 (3.84); 3.456 (2.58); 3.465 (1.35); 3.947 (9.47); 3.955 (15.45); 3.964 (8.40); 4.057 (0.45); 4.071 (1.28); 4.086 (1.30); 4.100 (0.49); 4.278 (4.64); 4.288 (6.97); 4.294 (4.07); 4.299 (4.02); 5.328 (1.19); 5.339 (2.69); 5.354 (2.69); 5.365 (1.19); 5.443 (0.90); 5.448 (1.32); 6.779 (4.78); 6.796 (5.27); 6.863 (2.26); 6.878 (4.67); 6.893 (2.69); 7.124 (2.45); 7.139 (3.94); 7.154 (2.07); 7.309 (4.10); 7.324 (3.86); 7.506 (4.42); 7.520 (5.68); 7.613 (3.66); 7.628 (5.26); 7.644 (3.03); 7.658 (2.51); 7.672 (4.37); 7.689 (3.02); 7.811 (6.72); 7.814 (7.13); 7.818 (4.61); 7.821 (6.00); 7.825 (7.74); 7.828 (6.36); 7.831 (5.94); 8.107 (5.62); 8.123 (5.32); 8.315 (4.53); 8.332 (4.30); 8.604 (16.00); 9.065 (6.90); 9.103 (2.34); 9.118 (2.15)
		LC-MS (方法 L4): Rt = 2.76 min; MS (ESIpos): m/z = 523 [M+H] ⁺

[1885]

252	2.23	¹ H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.0791 (1.76); 9.0587 (1.8); 8.5559 (7.36); 8.1993 (1.5); 8.1925 (1.41); 8.1814 (1.62); 8.1744 (1.67); 7.6235 (0.75); 7.6058 (2.84); 7.5938 (3.05); 7.5875 (6.22); 7.5767 (0.85); 7.5518 (1.11); 7.5301 (1.53); 7.4508 (0.54); 7.4455 (0.73); 7.4326 (1.69); 7.4272 (2.02); 7.4216 (1.16); 7.4156 (2.28); 7.4084 (1.97); 7.4032 (1.72); 7.3998 (1.7); 7.385 (0.7); 7.3589 (1.41); 7.3368 (1.88); 7.3173 (1.39); 7.1739 (0.83); 7.1704 (0.86); 7.1527 (1.79); 7.1353 (1.12); 7.1318 (1.06); 6.9096 (1.27); 6.8915 (2.21); 6.8728 (1.02); 6.7927 (2.53); 6.7726 (2.28); 5.7542 (1.11); 5.2513 (0.49); 5.2466 (1.08); 5.2274 (1.08); 5.213 (0.48); 4.2679 (1.84); 4.2559 (3.15); 4.2415 (1.82); 3.3206 (48.83); 3.1342 (16); 3.0049 (0.62); 2.9974 (0.88); 2.9893 (1.13); 2.981 (0.87); 2.9732 (0.63); 2.9642 (0.34); 2.675 (0.38); 2.6705 (0.51); 2.6658 (0.38); 2.5232 (1.39); 2.5055 (63.06); 2.5011 (96.29); 2.4969 (64.79); 2.3323 (0.36); 2.3281 (0.5); 2.1894 (0.6); 2.1757 (0.69); 2.1696 (0.51); 2.156 (0.74); 2.1399 (0.74); 2.0304 (0.61); 2.0184 (0.69); 1.9669 (0.54); 1.9683 (0.86); 1.3979 (1.47); 0.6101 (1.75); 0.4165 (0.89); 0.0078 (0.39); -0.0001 (10.71); -0.0076 (0.41)
253	2.8	¹ H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.0796 (1.17); 9.0621 (1.2); 8.5624 (8.02); 8.2214 (0.93); 8.2105 (1.57); 8.1983 (1.03); 7.6978 (2.04); 7.694 (2.19); 7.6778 (2.53); 7.674 (2.5); 7.6177 (5.4); 7.6041 (4.04); 7.4523 (0.69); 7.4433 (0.72); 7.4327 (1.48); 7.4239 (1.42); 7.4131 (0.92); 7.4041 (0.85); 7.3455 (1.88); 7.329 (3.1); 7.3099 (1.5); 7.174 (0.81); 7.1702 (0.85); 7.1526 (1.69); 7.1353 (1.08); 7.1317 (1.05); 6.9092 (1.19); 6.8909 (2.03); 6.8721 (0.94); 6.793 (2.33); 6.791 (2.35); 6.7726 (2.13); 6.7706 (2.07); 5.2566 (0.41); 5.242 (0.94); 5.2229 (0.94); 5.2089 (0.4); 4.2665 (1.65); 4.2545 (2.8); 4.2402 (1.64); 3.3211 (41.34); 3.1368 (16); 3.0138 (0.45); 3.0047 (0.7); 2.9975 (0.96); 2.9893 (0.98); 2.9811 (0.72); 2.9735 (0.43); 2.6703 (0.39); 2.5235 (1.05); 2.51 (22.39); 2.5056 (47.11); 2.501 (65.73); 2.4966 (49.19); 2.4922 (23.62); 2.3279 (0.38); 2.1883 (0.57); 2.1742 (0.65); 2.1681 (0.49); 2.1546 (0.71); 2.1385 (0.72); 2.0349 (0.45); 2.0228 (0.65); 2.0115 (0.58); 2.0017 (0.49); 1.9882 (1.44); 1.9759 (0.32); 1.3975 (1.3); 1.175 (0.52); 0.6137 (1.77); 0.5976 (1.39); 0.4649 (0.32); 0.4414 (0.56); 0.4091 (1.27); 0.3695 (0.52); 0.0081 (0.44); -0.0002 (13.08); -0.0084 (0.42)
254	3.81	¹ H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.0974 (1.83); 9.0773 (1.86); 8.6752 (7.71); 8.3134 (0.64); 8.2118 (1.85); 8.2091 (1.97); 8.1907 (2.14); 8.1877 (2.13); 7.7947 (1.87); 7.7919 (1.98); 7.777 (2.41); 7.741 (2.31); 7.6416 (5.47); 7.6376 (12.68); 7.632 (5.99); 7.6281 (3.45); 7.6155 (1.99); 7.6126 (2.16); 7.5945 (1.52); 7.3629 (1.74); 7.3442 (1.88); 7.1889 (0.84); 7.1854 (0.87); 7.1674 (1.81); 7.1502 (1.1); 7.147 (1.07); 6.9334 (1.31); 6.9152 (2.18); 6.8988 (1.01); 6.8964 (1.02); 6.8069 (2.45); 6.7867 (2.52); 5.2728 (0.51); 5.2582 (1.13); 5.2387 (1.12); 5.2248 (0.5); 4.281 (1.89); 4.2694 (3.1); 4.2546 (1.8); 3.184 (46.33); 3.1217 (16); 3.0207 (0.68); 3.0129 (0.98); 3.0047 (1.28); 2.9963 (0.95); 2.9888 (0.68); 2.9802 (0.33); 2.6749 (0.85); 2.6706 (1.14); 2.6661 (0.85); 2.5101 (68.82); 2.5059 (137.4); 2.5014 (187.25); 2.4971 (140.59); 2.3327 (0.8); 2.3283 (1.08); 2.3241 (0.79); 2.2024 (0.56); 2.1881 (0.67); 2.1696 (0.74); 2.1535 (0.7); 2.0686 (0.34); 2.0557 (0.71); 2.0447 (0.85); 2.0308 (0.51); 2.0226 (0.61); 2.0084 (0.53); 1.398 (3.21); 0.6121 (2.33); 0.5962 (2.26); 0.4148 (1.1); 0.4089 (1.1); 0.3834 (1.16); 0.0079 (1.22); -0.0002 (28.51); -0.0084 (1.03)
255		¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ (ppm): -0.149 (0.40), -0.008 (3.66), 0.008 (2.37), 1.938 (0.67), 2.015 (1.79), 2.073 (1.20), 2.179 (0.64), 2.328 (0.62), 2.366 (0.70), 2.385 (0.71), 2.669 (0.51), 3.356 (0.75), 3.498 (16.00), 3.893 (0.87), 3.915 (0.80), 4.216 (0.97), 4.238 (0.76), 4.267 (0.81), 4.625 (0.99), 4.640 (1.04), 4.659 (0.92), 5.267 (0.86), 6.791 (1.73), 6.810 (1.94), 6.925 (0.82), 6.941 (1.72), 6.959 (1.12), 7.168 (0.89), 7.185 (1.41), 7.202 (0.70), 7.394 (1.48), 7.411 (1.37), 7.645 (11.29), 7.673 (1.76), 7.694 (1.53), 7.820 (1.92), 7.838 (1.61), 8.342 (1.64), 8.361 (1.56), 8.671 (6.40), 9.188 (1.55), 9.208 (1.60).

[1886]

256	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.91 min, MS (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.12 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.43 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.93 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.69 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.37 – 7.29 (m, 3H), 7.20 – 7.13 (m, 1H), 6.94 – 6.87 (m, 1H), 6.79 (dd, J = 8.2, 1.0 Hz, 1H), 5.26 – 5.19 (m)
257	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.71 min, MS (ESipos): m/z = 502 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.43), 0.146 (0.47), 1.754 (0.43), 1.862 (3.00), 1.901 (2.89), 1.909 (2.71), 2.031 (4.75), 2.040 (4.61), 2.049 (5.14), 2.157 (2.74), 2.171 (3.27), 2.186 (2.55), 2.203 (1.78), 2.327 (0.93), 2.366 (0.74), 2.670 (0.93), 2.709 (0.69), 3.038 (0.45), 3.165 (1.51), 3.210 (0.53), 3.232 (0.51), 3.476 (2.42), 3.502 (4.70), 3.528 (2.55), 3.654 (0.43), 3.708 (1.60), 3.732 (3.42), 3.752 (2.34), 3.780 (1.22), 3.802 (2.18), 3.820 (2.17), 3.829 (2.57), 3.851 (3.64), 3.861 (4.91), 3.875 (4.51), 3.888 (3.51), 3.900 (2.05), 4.169 (4.22), 4.258 (8.39), 4.267 (9.23), 4.280 (4.38), 4.372 (4.77), 5.035 (5.52), 5.201 (1.06), 5.214 (2.86), 5.227 (3.55), 5.235 (3.58), 5.247 (2.92), 5.261 (1.17), 6.782 (7.98), 6.801 (8.91), 6.893 (3.82), 6.912 (8.02), 6.930 (4.96), 7.145 (4.32), 7.163 (6.95), 7.182 (3.56), 7.211 (2.94), 7.216 (2.31), 7.234 (5.55), 7.240 (4.20), 7.258 (3.02), 7.263 (2.33), 7.307 (16.00), 7.324 (15.84), 7.361 (1.03), 7.377 (1.64), 7.399 (0.96), 7.467 (4.96), 7.486 (7.17), 7.507 (5.81), 7.704 (8.95), 7.722 (7.93), 7.742 (0.47), 7.887 (0.48), 7.901 (0.42), 8.134 (12.65), 8.269 (7.33), 8.291 (7.25), 8.313 (0.63), 8.394 (1.77), 8.432 (13.03), 8.436 (13.82), 8.810 (1.36), 9.046 (5.84), 9.067 (5.58), 12.645 (0.58).
258	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.25 min, MS (ESineg): m/z = 516 [M-H] ⁻	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.99), 0.146 (1.21), 1.055 (1.10), 1.243 (0.89), 1.862 (1.56), 1.907 (1.99), 2.038 (4.22), 2.085 (2.63), 2.159 (2.66), 2.327 (2.09), 2.366 (1.38), 2.669 (2.27), 2.710 (1.45), 3.509 (1.42), 3.743 (1.67), 3.873 (4.19), 4.251 (8.12), 4.394 (3.19), 5.059 (2.13), 5.200 (3.33), 5.754 (16.00), 6.776 (5.14), 6.796 (5.68), 6.875 (3.87), 6.893 (7.49), 6.912 (4.43), 7.138 (3.69), 7.157 (5.46), 7.177 (3.37), 7.289 (6.17), 7.307 (5.53), 7.448 (3.87), 8.132 (3.30), 8.325 (3.87), 9.046 (1.53), 12.220 (0.64).
259	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.24 min, MS (ESipos): m/z = 518 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (1.71), -0.008 (15.12), 0.008 (13.06), 0.146 (1.65), 1.038 (1.12), 1.055 (2.24), 1.073 (1.12), 1.236 (0.71), 1.862 (3.06), 1.908 (2.82), 2.039 (5.47), 2.085 (3.00), 2.146 (3.35), 2.160 (3.59), 2.180 (2.88), 2.195 (2.53), 2.327 (2.82), 2.332 (2.06), 2.366 (2.29), 2.523 (8.71), 2.669 (2.59), 2.690 (0.53), 2.709 (2.24), 3.509 (2.00), 3.744 (2.29), 3.874 (5.88), 4.238 (8.06), 4.253 (10.94), 4.388 (4.47), 5.054 (3.29), 5.205 (4.24), 5.218 (4.18), 5.754 (16.00), 6.774 (7.12), 6.795 (7.59), 6.878 (5.12), 6.896 (10.53), 6.915 (6.06), 7.139 (4.65), 7.157 (7.24), 7.177 (3.76), 7.235 (2.47), 7.290 (10.82), 7.309 (9.65), 7.501 (2.94), 7.561 (4.94), 8.132 (6.47), 8.337 (6.94), 9.043 (2.35), 12.703 (0.71).
260	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.72 min, MS (ESipos): m/z = 500 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.898 (1.49), 1.907 (1.43), 2.003 (1.23), 2.023 (2.16), 2.034 (2.52), 2.054 (2.37), 2.156 (1.33), 2.170 (1.58), 2.186 (1.26), 2.202 (0.87), 3.169 (4.19), 3.191 (0.45), 3.203 (0.59), 3.213 (0.51), 3.226 (0.59), 3.305 (1.15), 3.472 (1.52), 3.498 (2.71), 3.524 (1.46), 3.696 (0.91), 3.720 (1.91), 3.741 (1.28), 3.776 (0.63), 3.798 (1.12), 3.817 (1.15), 3.826 (1.36), 3.841 (1.73), 3.853 (2.81), 3.867 (2.34), 3.881 (1.91), 3.893 (1.16), 4.168 (2.20), 4.258 (4.22), 4.266 (4.57), 4.376 (2.54), 5.217 (1.39), 5.228 (1.80), 5.248 (1.46), 5.753 (16.00), 6.780 (4.05), 6.800 (4.44), 6.892 (1.82), 6.910 (3.93), 6.929 (2.45), 7.143 (2.06), 7.162 (3.40), 7.181 (1.72), 7.306 (3.35), 7.325 (3.06), 7.417 (1.77), 7.436 (4.71), 7.450 (3.62), 7.469 (5.99), 7.487 (4.73), 7.503 (3.14), 7.521 (4.74), 7.540 (2.68), 7.635 (6.07), 7.659 (4.38), 7.677 (3.91), 8.153 (14.28), 8.247 (3.60), 8.268 (3.45), 8.421 (6.72), 8.425 (7.54), 8.792 (0.74), 9.041 (2.88), 9.062 (2.77).

[1887]

261	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.75 min, MS (ESIpos): m/z = 530 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (1.36), 0.008 (1.23), 1.897 (0.69), 2.031 (1.04), 2.050 (1.12), 2.156 (0.59), 2.170 (0.71), 2.185 (0.60), 3.169 (0.99), 3.191 (0.41), 3.203 (0.54), 3.212 (0.50), 3.226 (0.59), 3.305 (1.07), 3.464 (0.73), 3.490 (1.25), 3.518 (0.67), 3.712 (0.82), 3.734 (0.57), 3.790 (0.55), 3.814 (16.00), 3.829 (3.10), 3.847 (1.23), 3.861 (1.14), 3.874 (1.02), 3.887 (0.52), 4.163 (2.59), 4.258 (1.91), 4.266 (2.12), 4.374 (1.12), 5.234 (0.76), 5.245 (0.63), 5.754 (0.64), 6.781 (1.81), 6.799 (2.04), 6.893 (0.86), 6.912 (1.84), 6.930 (1.24), 7.025 (1.53), 7.030 (2.93), 7.035 (1.95), 7.075 (2.47), 7.079 (2.80), 7.127 (0.40), 7.145 (0.92), 7.162 (1.62), 7.183 (2.94), 7.186 (3.43), 7.231 (0.46), 7.307 (1.49), 7.326 (1.37), 7.451 (1.09), 7.469 (1.61), 7.490 (1.32), 7.659 (1.99), 7.675 (1.69), 8.151 (5.55), 8.239 (1.63), 8.260 (1.58), 8.422 (3.41), 8.427 (3.75), 8.793 (0.92), 9.041 (1.50), 9.062 (1.45).
262	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.28 min, MS (ESIpos): m/z = 518 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.82), -0.008 (6.72), 0.008 (6.87), 0.146 (0.82), 0.889 (0.41), 1.236 (0.68), 1.862 (2.00), 1.904 (2.50), 2.036 (4.81), 2.057 (3.23), 2.073 (2.59), 2.148 (2.61), 2.162 (3.02), 2.178 (2.26), 2.196 (1.91), 2.327 (1.88), 2.366 (1.20), 2.523 (5.70), 2.669 (1.82), 2.709 (1.09), 3.524 (2.23), 3.755 (2.17), 3.818 (2.88), 3.885 (3.41), 4.175 (1.41), 4.243 (6.72), 4.256 (8.63), 4.379 (4.34), 5.041 (4.81), 5.211 (3.38), 5.224 (3.41), 5.754 (2.38), 6.794 (8.22), 6.883 (3.88), 6.899 (8.07), 6.918 (4.81), 7.139 (4.20), 7.156 (6.55), 7.174 (3.29), 7.295 (8.04), 7.312 (8.40), 7.326 (3.90), 7.367 (3.20), 7.383 (4.29), 7.400 (2.00), 7.487 (2.08), 7.506 (3.58), 7.525 (2.50), 7.634 (5.31), 8.133 (16.00), 8.325 (4.08), 8.360 (8.78), 9.040 (2.67), 9.057 (2.67), 12.699 (1.38).
263	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.33 min, MS (ESIpos): m/z = 576 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (1.65), 0.008 (1.52), 1.234 (0.49), 2.012 (0.66), 2.029 (0.92), 2.045 (0.89), 2.059 (1.10), 2.075 (1.44), 2.091 (1.89), 2.105 (1.51), 2.122 (0.75), 2.141 (0.59), 2.187 (0.65), 2.204 (0.65), 2.223 (0.59), 2.237 (0.50), 2.470 (0.58), 2.523 (1.48), 3.358 (0.47), 3.375 (0.74), 3.392 (0.84), 3.410 (0.50), 3.489 (16.00), 3.885 (0.41), 3.901 (0.97), 3.922 (0.95), 3.939 (0.41), 4.277 (1.55), 4.291 (2.65), 4.303 (1.60), 4.716 (1.07), 4.729 (1.23), 4.737 (1.20), 4.750 (1.01), 5.254 (0.41), 5.268 (0.92), 5.288 (0.94), 5.301 (0.42), 5.754 (8.22), 6.784 (1.67), 6.804 (1.85), 6.888 (0.85), 6.891 (0.84), 6.906 (1.80), 6.925 (1.08), 7.143 (0.86), 7.147 (0.92), 7.164 (1.44), 7.182 (0.72), 7.186 (0.72), 7.292 (1.53), 7.311 (1.42), 7.639 (1.85), 7.643 (3.39), 7.648 (8.87), 7.652 (4.00), 7.673 (1.82), 7.676 (1.64), 7.694 (1.64), 7.821 (2.01), 7.824 (2.06), 7.839 (1.67), 7.842 (1.59), 8.351 (1.69), 8.354 (1.71), 8.372 (1.62), 8.375 (1.52), 8.678 (6.32), 9.190 (1.68), 9.210 (1.63).
264	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.53 min, MS (ESIpos): m/z = 546 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.146 (0.40), 1.139 (16.00), 1.158 (15.94), 1.234 (0.94), 1.963 (2.29), 1.974 (2.70), 2.061 (3.26), 2.078 (3.19), 2.097 (1.79), 2.163 (1.02), 2.327 (0.81), 2.670 (0.80), 2.710 (0.44), 3.615 (2.37), 4.233 (1.49), 4.254 (2.33), 4.262 (2.43), 5.217 (1.48), 5.236 (1.45), 5.754 (5.93), 6.777 (2.79), 6.798 (3.23), 6.902 (1.43), 6.921 (2.91), 6.940 (1.74), 7.146 (1.44), 7.166 (2.27), 7.184 (1.15), 7.347 (2.34), 7.365 (2.28), 7.641 (4.23), 7.646 (4.54), 7.657 (14.09), 7.661 (8.47), 7.678 (2.81), 7.698 (2.23), 7.819 (3.12), 7.837 (2.42), 8.297 (2.64), 8.318 (2.50), 8.803 (9.16), 8.970 (2.59), 8.991 (2.51).
265	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.89 min, MS (ESIpos): m/z = 492 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 9.00 (d, 1H), 8.51 (s, 1H), 8.41 (d, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.82 (t, 1H), 7.70 - 7.76 (m, 1H), 7.58 - 7.64 (m, 3H), 7.53 (dd, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.13 - 7.20 (m, 1H), 6.86 - 6.96 (m, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.19 - 5.30 (m, 1H), 4.21 - 4.33 (m, 2H), 3.48 - 3.59 (m, 2H), 1.96 - 2.22 (m, 2H), 1.25 (t, 3H).

[1888]

266	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.91 min; MS (ESIpos): m/z = 562 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.007 (3.09), 0.006 (1.99), 1.907 (2.42), 2.028 (0.58), 2.033 (0.60), 2.044 (0.71), 2.056 (0.83), 2.166 (0.52), 2.175 (0.71), 2.185 (0.75), 2.193 (0.77), 2.204 (0.50), 2.358 (0.89), 2.361 (1.22), 2.365 (0.93), 2.369 (0.58), 2.392 (0.70), 2.407 (0.71), 2.514 (3.50), 2.518 (3.01), 2.522 (2.34), 2.631 (0.87), 2.635 (1.14), 2.639 (0.81), 3.866 (0.46), 3.878 (1.06), 3.895 (0.91), 4.183 (0.43), 4.188 (0.44), 4.205 (1.12), 4.224 (0.89), 4.229 (0.73), 4.243 (0.75), 4.250 (1.08), 4.262 (0.91), 4.277 (0.46), 4.638 (0.83), 4.649 (1.02), 4.654 (1.33), 4.665 (1.06), 5.254 (0.54), 5.264 (1.14), 5.280 (1.10), 5.291 (0.50), 6.786 (2.22), 6.788 (2.18), 6.802 (2.42), 6.804 (2.32), 6.919 (1.16), 6.921 (1.08), 6.933 (2.26), 6.935 (2.11), 6.948 (1.31), 6.950 (1.18), 7.169 (1.12), 7.172 (1.16), 7.186 (1.76), 7.200 (0.93), 7.203 (0.89), 7.388 (1.80), 7.403 (1.70), 7.629 (1.72), 7.634 (4.02), 7.637 (8.89), 7.639 (16.00), 7.642 (4.87), 7.652 (2.18), 7.654 (1.91), 7.669 (1.82), 7.806 (2.51), 7.809 (2.42), 7.821 (2.05), 7.823 (1.86), 8.303 (1.86), 8.320 (1.72), 8.680 (8.25), 12.586 (0.91).
267	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.85 min; MS (ESIpos): m/z = 530 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.068 (1.35), 2.198 (1.21), 2.210 (1.21), 2.220 (1.14), 3.278 (5.85), 3.289 (6.25), 3.311 (12.56), 3.604 (16.00), 4.215 (0.92), 4.237 (1.78), 4.265 (2.72), 5.246 (1.68), 5.263 (1.68), 5.753 (4.55), 6.780 (2.37), 6.800 (2.65), 6.899 (1.40), 6.917 (2.61), 6.935 (1.60), 7.114 (2.89), 7.136 (3.72), 7.164 (2.76), 7.181 (4.24), 7.186 (4.32), 7.355 (2.53), 7.374 (2.43), 7.410 (2.28), 7.415 (2.25), 7.432 (2.02), 7.437 (1.87), 7.527 (0.74), 7.547 (0.73), 7.582 (0.60), 7.629 (6.11), 7.647 (3.02), 7.665 (1.10), 8.224 (2.04), 8.238 (1.98), 8.571 (5.47), 9.139 (2.37), 9.159 (2.29).
268	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.68 min; MS (ESIpos): m/z = 514 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.008 (1.66), 2.032 (1.12), 2.040 (1.20), 2.051 (1.31), 2.057 (1.32), 2.067 (1.86), 2.072 (1.94), 2.082 (1.19), 2.090 (0.84), 2.178 (0.94), 2.187 (1.30), 2.199 (1.63), 2.211 (1.54), 2.221 (1.49), 2.233 (0.98), 2.242 (0.78), 2.254 (0.49), 2.669 (0.48), 3.233 (0.95), 3.245 (1.65), 3.264 (4.14), 3.277 (8.27), 3.290 (9.38), 3.303 (8.05), 3.310 (8.12), 3.608 (4.08), 3.694 (1.02), 3.841 (0.90), 3.860 (7.34), 3.871 (12.70), 3.882 (7.04), 3.901 (0.86), 4.165 (0.48), 4.175 (0.48), 4.183 (0.53), 4.208 (0.81), 4.216 (1.03), 4.236 (2.56), 4.244 (2.08), 4.257 (3.61), 4.267 (3.55), 4.274 (2.38), 4.283 (2.35), 4.296 (0.92), 4.302 (0.93), 5.186 (0.41), 5.232 (1.10), 5.246 (2.38), 5.265 (2.35), 5.280 (1.03), 5.753 (0.98), 6.749 (0.48), 6.780 (4.50), 6.800 (5.03), 6.834 (0.58), 6.854 (0.72), 6.871 (0.52), 6.897 (2.22), 6.916 (4.62), 6.934 (2.69), 6.999 (3.38), 7.007 (3.89), 7.021 (3.65), 7.029 (3.73), 7.042 (0.46), 7.075 (2.55), 7.087 (2.73), 7.098 (4.07), 7.110 (4.00), 7.143 (2.39), 7.147 (2.50), 7.164 (4.00), 7.176 (2.61), 7.184 (4.22), 7.197 (3.38), 7.205 (3.28), 7.219 (1.66), 7.228 (1.63), 7.245 (0.65), 7.265 (0.49), 7.355 (3.98), 7.373 (3.68), 7.519 (0.46), 7.540 (0.43), 7.584 (0.65), 7.599 (0.48), 7.609 (0.82), 7.615 (2.02), 7.629 (9.79), 7.648 (5.53), 7.666 (1.75), 8.217 (3.69), 8.223 (3.68), 8.236 (3.32), 8.242 (3.35), 8.280 (0.46), 8.532 (1.30), 8.572 (16.00), 9.118 (0.49), 9.140 (4.50), 9.160 (4.10).

[1889]

269	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.149 (0.88), -0.008 (8.18), 0.008 (7.45), 0.146 (0.90), 1.862 (1.33), 1.901 (1.64), 2.006 (1.70), 2.026 (2.93), 2.039 (3.18), 2.058 (1.87), 2.071 (1.25), 2.144 (1.40), 2.158 (1.62), 2.174 (1.40), 2.192 (1.09), 2.327 (1.27), 2.366 (0.88), 2.669 (1.35), 2.709 (0.82), 2.988 (0.49), 3.018 (0.82), 3.080 (0.76), 3.090 (0.82), 3.120 (0.64), 3.168 (3.38), 3.189 (1.64), 3.199 (1.70), 3.212 (1.83), 3.304 (6.01), 3.458 (2.03), 3.487 (2.61), 3.517 (1.76), 3.654 (0.60), 3.683 (1.07), 3.692 (1.19), 3.715 (2.54), 3.728 (1.58), 3.736 (1.37), 3.767 (0.66), 3.789 (1.35), 3.807 (1.58), 3.831 (1.83), 3.847 (3.20), 3.861 (2.56), 3.874 (3.40), 3.888 (1.23), 4.152 (7.55), 4.252 (5.35), 4.377 (2.97), 5.035 (0.45), 5.209 (1.89), 5.225 (1.93), 5.264 (0.43), 6.772 (4.37), 6.790 (5.03), 6.809 (0.90), 6.878 (2.19), 6.897 (4.78), 6.916 (3.30), 6.935 (0.49), 7.094 (6.19), 7.116 (7.26), 7.135 (2.60), 7.153 (4.41), 7.161 (6.99), 7.168 (8.02), 7.214 (1.25), 7.221 (1.29), 7.289 (3.71), 7.307 (3.41), 7.341 (0.72), 7.361 (0.64), 7.384 (4.27), 7.390 (4.02), 7.406 (3.71), 7.412 (3.61), 7.421 (3.04), 7.440 (4.06), 7.450 (1.05), 7.460 (3.61), 7.501 (5.07), 7.504 (5.29), 7.518 (3.34), 7.659 (1.00), 7.677 (1.58), 8.177 (16.00), 8.233 (4.10), 8.254 (3.80), 8.331 (8.27), 8.335 (8.60), 8.688 (2.58), 9.014 (2.13), 9.024 (2.44), 9.035 (2.24), 9.045 (2.24), 9.145 (0.62), 9.165 (0.59).</p>	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 0.75 min; MS (ESIpos): m/z = 530 [M+H]⁺</p>	
270	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.008 (2.06), 0.008 (2.02), 1.862 (0.52), 1.902 (0.65), 1.991 (0.45), 2.008 (0.70), 2.029 (1.17), 2.041 (1.33), 2.052 (0.81), 2.062 (0.77), 2.074 (0.49), 2.085 (0.95), 2.145 (0.64), 2.159 (0.70), 2.175 (0.54), 2.194 (0.46), 3.468 (0.59), 3.498 (0.87), 3.528 (0.48), 3.592 (16.00), 3.702 (0.50), 3.722 (0.73), 3.738 (0.54), 3.795 (0.43), 3.813 (0.59), 3.833 (0.70), 3.855 (1.29), 3.868 (0.86), 3.881 (0.82), 3.893 (0.49), 4.151 (0.44), 4.241 (1.65), 4.254 (2.29), 4.378 (1.10), 5.041 (0.99), 5.210 (0.85), 5.224 (0.81), 5.753 (5.11), 6.773 (1.87), 6.793 (2.06), 6.877 (0.94), 6.896 (1.98), 6.914 (1.21), 6.988 (0.94), 6.995 (1.10), 7.010 (0.97), 7.018 (1.04), 7.061 (0.93), 7.072 (1.01), 7.084 (1.51), 7.095 (1.44), 7.136 (1.03), 7.156 (2.10), 7.165 (0.92), 7.177 (1.39), 7.186 (1.11), 7.200 (0.54), 7.208 (0.52), 7.289 (1.68), 7.307 (1.53), 7.430 (0.89), 7.448 (1.57), 7.469 (1.45), 7.511 (1.95), 7.528 (1.16), 8.134 (5.18), 8.235 (1.56), 8.256 (1.45), 8.331 (2.76), 8.335 (3.59), 9.027 (0.68), 9.036 (0.99), 9.047 (0.75), 9.057 (0.91).</p>	<p>LC-MS (方法 L6): Rt = 1.17 min; MS (ESIpos): m/z = 514 [M+H]⁺</p>	
271	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.150 (0.71), -0.008 (7.12), 0.008 (7.07), 0.146 (0.81), 1.157 (4.10), 1.175 (8.25), 1.192 (4.07), 1.234 (4.37), 1.258 (1.96), 1.298 (1.33), 1.759 (1.96), 1.913 (1.69), 1.988 (16.00), 2.051 (3.21), 2.153 (1.72), 2.168 (1.96), 2.328 (1.18), 2.366 (0.83), 2.669 (1.15), 3.482 (1.52), 3.509 (3.31), 3.537 (1.72), 3.601 (1.72), 3.749 (2.23), 3.858 (2.43), 3.871 (2.40), 3.884 (2.97), 3.898 (2.04), 4.003 (1.13), 4.021 (3.58), 4.038 (3.51), 4.056 (1.20), 4.179 (2.43), 4.265 (5.40), 4.372 (2.70), 5.035 (4.93), 5.231 (2.18), 5.753 (0.91), 6.782 (5.20), 6.802 (5.72), 6.891 (2.33), 6.910 (5.06), 6.928 (3.21), 7.141 (2.50), 7.162 (4.22), 7.184 (2.11), 7.304 (4.32), 7.322 (4.02), 7.480 (3.31), 7.499 (4.47), 7.519 (3.68), 7.757 (5.37), 7.774 (4.66), 7.854 (7.12), 7.898 (7.95), 7.970 (7.83), 8.137 (1.03), 8.299 (3.12), 8.322 (3.07), 8.420 (9.50), 8.427 (9.79), 8.604 (0.96), 9.056 (3.41), 9.075 (3.53).</p>	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 0.78 min; MS (ESIpos): m/z = 568 [M+H]⁺</p>	

[1890]

272	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ (ppm): -0.150 (0.66), -0.008 (6.04), 0.008 (5.39), 0.146 (0.68), 1.902 (1.46), 1.911 (1.34), 2.001 (1.38), 2.011 (1.72), 2.032 (2.75), 2.042 (2.15), 2.148 (1.40), 2.161 (1.58), 2.177 (1.24), 2.195 (0.96), 2.270 (16.00), 2.327 (0.88), 2.332 (0.72), 2.366 (0.84), 2.522 (2.61), 2.669 (0.86), 2.709 (0.78), 3.209 (0.40), 3.232 (0.44), 3.479 (1.26), 3.507 (2.19), 3.637 (1.20), 3.738 (1.70), 3.758 (1.16), 3.790 (0.66), 3.813 (1.00), 3.830 (1.10), 3.848 (1.30), 3.857 (1.48), 3.870 (2.75), 3.883 (2.11), 3.896 (1.78), 3.909 (1.08), 4.169 (2.17), 4.244 (3.65), 4.256 (4.49), 4.374 (2.29), 5.034 (3.53), 5.212 (1.76), 5.225 (1.74), 5.233 (1.40), 5.753 (11.87), 6.774 (3.91), 6.793 (4.33), 6.881 (2.01), 6.900 (4.21), 6.918 (2.63), 7.135 (2.07), 7.138 (2.15), 7.156 (3.47), 7.174 (1.84), 7.177 (1.76), 7.240 (1.90), 7.247 (2.25), 7.254 (2.13), 7.261 (2.07), 7.295 (3.59), 7.314 (3.31), 7.405 (2.07), 7.411 (2.15), 7.420 (2.31), 7.426 (2.01), 7.458 (2.45), 7.477 (3.53), 7.498 (3.05), 7.604 (4.17), 7.621 (3.31), 8.133 (5.33), 8.299 (3.03), 8.321 (2.85), 8.361 (7.30), 8.365 (8.02), 8.733 (0.70), 9.030 (2.93), 9.051 (2.79).</p>	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.74 min; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H] ⁺	
273	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ (ppm): -0.008 (2.37), 0.008 (2.35), 0.551 (0.53), 0.566 (0.84), 0.576 (1.24), 0.588 (1.45), 0.599 (1.08), 0.611 (1.48), 0.622 (1.39), 0.632 (0.86), 0.646 (0.65), 0.774 (0.62), 0.784 (0.88), 0.791 (1.19), 0.801 (1.30), 0.811 (1.67), 0.817 (1.59), 0.828 (1.34), 0.846 (0.86), 0.855 (0.59), 1.157 (4.26), 1.175 (8.61), 1.193 (4.39), 1.988 (16.00), 2.033 (0.49), 2.041 (0.65), 2.051 (0.77), 2.059 (0.84), 2.067 (1.09), 2.075 (1.07), 2.086 (1.16), 2.108 (0.49), 2.129 (0.92), 2.141 (0.96), 2.150 (0.81), 2.163 (0.50), 2.176 (0.40), 2.523 (1.27), 3.074 (1.32), 3.081 (1.31), 4.003 (1.26), 4.021 (3.80), 4.038 (3.76), 4.056 (1.22), 4.229 (0.56), 4.237 (0.42), 4.248 (1.37), 4.257 (1.41), 4.268 (1.85), 4.276 (1.87), 4.288 (1.35), 4.296 (1.55), 4.316 (0.56), 5.210 (0.65), 5.225 (1.45), 5.244 (1.46), 5.259 (0.63), 6.783 (2.84), 6.804 (3.11), 6.881 (1.36), 6.884 (1.39), 6.900 (2.84), 6.902 (2.84), 6.918 (1.71), 6.921 (1.66), 7.139 (1.38), 7.143 (1.48), 7.160 (2.30), 7.178 (1.14), 7.182 (1.14), 7.290 (2.42), 7.309 (2.25), 7.495 (2.03), 7.513 (2.65), 7.515 (2.51), 7.534 (2.35), 7.593 (1.59), 7.598 (3.85), 7.602 (4.25), 7.614 (14.30), 7.618 (8.44), 7.726 (3.30), 7.742 (2.69), 7.744 (2.68), 8.497 (2.63), 8.581 (9.25), 8.625 (2.55), 8.644 (2.39), 8.925 (2.56), 8.945 (2.48).</p>	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.74 min; MS (ESIpos): m/z = 504 [M+H] ⁺	
274	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ (ppm): -0.149 (0.88), 0.146 (0.84), 2.052 (4.40), 2.056 (4.83), 2.214 (1.52), 2.327 (1.69), 2.367 (1.09), 2.669 (1.57), 2.709 (0.86), 3.395 (1.87), 3.910 (1.80), 3.929 (1.91), 4.172 (0.60), 4.289 (4.76), 4.731 (1.76), 4.745 (2.27), 4.764 (1.74), 5.301 (1.84), 5.318 (1.95), 6.770 (3.24), 6.790 (3.65), 6.854 (1.59), 6.872 (3.37), 6.890 (2.08), 7.129 (1.78), 7.146 (2.92), 7.165 (1.59), 7.303 (3.15), 7.322 (2.98), 7.643 (16.00), 7.674 (2.68), 7.808 (3.99), 7.825 (3.00), 8.323 (3.22), 8.343 (2.92), 8.686 (8.56), 9.294 (0.92), 12.581 (0.51).</p>	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.87 min; MS (ESIpos): m/z = 562 [M+H] ⁺	
275	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ (ppm): 1.899 (0.93), 2.033 (1.88), 2.162 (1.12), 2.178 (0.96), 2.337 (16.00), 2.669 (0.47), 3.305 (4.05), 3.485 (0.97), 3.512 (1.74), 3.538 (0.94), 3.742 (1.19), 3.817 (0.74), 3.849 (0.94), 3.873 (2.10), 3.885 (1.33), 3.899 (1.41), 3.911 (0.81), 4.257 (3.03), 4.375 (1.62), 5.036 (0.83), 5.212 (1.24), 6.773 (2.99), 6.793 (3.25), 6.884 (1.29), 6.902 (2.92), 6.920 (1.71), 7.138 (1.51), 7.157 (4.16), 7.174 (3.09), 7.296 (2.55), 7.314 (2.22), 7.418 (2.01), 7.431 (2.00), 7.467 (1.65), 7.484 (2.51), 7.506 (2.14), 7.606 (3.17), 7.623 (2.58), 8.136 (11.05), 8.306 (2.13), 8.327 (1.99), 8.361 (5.15), 8.365 (5.57), 9.029 (2.00), 9.051 (1.92).</p>	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.37 min; MS (ESIpos): m/z = 532 [M+H] ⁺	
276	<p>¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆): δ (ppm)= 8.98 (d, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.22 (br d, 1H), 8.03 (br s, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.52 - 7.66 (m, 4H), 7.33 (d, 1H), 7.15 (t, 1H), 6.90 (t, 1H), 6.78 (d, 1H), 5.18 - 5.33 (m, 1H), 4.19 - 4.33 (m, 2H), 3.80 (br s, 2H), 1.99 - 2.23 (m, 2H).</p>	LC-MS (方法 L6): Rt = 0.80 min; MS (ESIpos): m/z = 522 [M+H] ⁺	

[1891]

277	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.86 min; m/z = 460 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.28 (m, 1H), 7.78 - 7.62 (m, 2H), 7.51 (m, 1H), 7.35 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.25 - 7.11 (m, 3H), 6.91 (m, 1H), 6.83 - 6.75 (m, 1H), 5.24 (q, J = 5.8 Hz, 1H), 4.25 (dt, J = 7.8, 4.8 Hz, 2H)
278	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.64 min; m/z = 520 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.40 (dd, J = 9.4, 6.3 Hz, 1H), 7.70 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 7.65 - 7.55 (m, 1H), 7.36 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.30 - 7.21 (m, 2H), 7.20 - 7.13 (m, 1H), 6.95 - 6.87 (m, 1H), 6.79 (dd, J = 8.2,
279	LC-MS (方法 L3): Rt = 3.83 min; m/z = 478 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.37 (dd, J = 9.4, 6.3 Hz, 1H), 7.68 - 7.54 (m, 2H), 7.34 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.30 - 7.20 (m, 2H), 7.20 - 7.12 (m, 1H), 6.94 - 6.87 (m, 1H), 6.79 (dd, J = 8.2, 1.1 Hz, 1H), 5.27 - 5.19 (t, 4H), 2.16 - 2.28 (m, 1H), 2.00 - 2.11 (m, 1H).
280	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.89 min; MS (ESIpos): m/z = 507 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 9.19 (d, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.34 (dd, 1H), 7.81 - 7.90 (m, 2H), 7.75 (dd, 1H), 7.47 - 7.55 (m, 2H), 7.36 (d, 1H), 7.12 - 7.21 (m, 1H), 6.87 - 6.97 (m, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.20 - 5.32 (m, 1H), 4.18 - 4.33 (m, 2H), 3.89 (t, 4H), 2.16 - 2.28 (m, 1H), 2.00 - 2.11 (m, 1H).
281	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.59 min; MS (ESIpos): m/z = 576 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (1.22), 0.008 (1.27), 2.023 (0.43), 2.058 (0.74), 2.065 (0.63), 2.129 (0.65), 2.148 (0.95), 2.159 (1.39), 2.178 (1.50), 2.197 (0.65), 2.259 (0.60), 2.271 (0.78), 2.289 (0.71), 2.322 (0.52), 2.327 (0.59), 2.523 (1.62), 2.670 (0.57), 3.336 (1.52), 3.354 (0.97), 3.632 (0.46), 3.644 (0.81), 3.656 (0.92), 3.663 (0.86), 3.688 (16.00), 3.711 (1.43), 3.729 (0.81), 3.736 (1.08), 3.764 (1.60), 3.783 (1.39), 3.798 (1.66), 3.815 (1.41), 3.823 (0.84), 3.840 (0.60), 4.236 (1.01), 4.248 (1.31), 4.259 (1.81), 4.273 (1.00), 5.212 (0.93), 5.232 (0.97), 5.245 (0.41), 5.754 (0.44), 6.784 (1.82), 6.804 (1.98), 6.899 (0.92), 6.915 (1.93), 6.934 (1.14), 7.149 (0.92), 7.153 (0.95), 7.170 (1.52), 7.187 (0.76), 7.334 (1.55), 7.352 (1.44), 7.548 (1.35), 7.566 (1.81), 7.569 (1.62), 7.587 (1.49), 7.625 (12.56), 7.756 (2.12), 7.771 (1.68), 7.774 (1.70), 8.265 (1.73), 8.287 (1.54), 8.530 (5.88), 9.104 (1.73), 9.124 (1.66).
282	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.57 min; MS (ESIpos): m/z = 576 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.90), 0.008 (1.01), 1.356 (0.76), 2.020 (0.41), 2.030 (0.40), 2.056 (0.64), 2.064 (0.53), 2.115 (0.57), 2.134 (0.66), 2.146 (0.97), 2.164 (1.20), 2.184 (0.89), 2.196 (0.51), 2.261 (0.56), 2.273 (0.71), 2.280 (0.50), 2.292 (0.68), 2.323 (0.44), 2.327 (0.41), 2.523 (1.03), 3.333 (1.42), 3.352 (0.88), 3.653 (0.41), 3.665 (0.84), 3.684 (16.00), 3.702 (0.75), 3.721 (1.33), 3.739 (0.72), 3.745 (0.78), 3.776 (2.18), 3.779 (2.21), 3.797 (2.25), 4.241 (0.94), 4.250 (1.38), 4.261 (1.78), 5.218 (0.84), 5.238 (0.83), 5.754 (1.01), 6.784 (1.63), 6.804 (1.77), 6.895 (0.78), 6.897 (0.81), 6.915 (1.64), 6.932 (0.96), 6.934 (0.96), 7.147 (0.79), 7.151 (0.87), 7.168 (1.32), 7.186 (0.66), 7.190 (0.67), 7.328 (1.35), 7.345 (1.25), 7.544 (1.16), 7.562 (1.51), 7.566 (1.48), 7.584 (1.38), 7.624 (12.39), 7.752 (1.74), 7.755 (1.89), 7.770 (1.51), 7.772 (1.51), 8.250 (1.50), 8.253 (1.57), 8.271 (1.41), 8.274 (1.38), 8.524 (5.96), 9.102 (1.54), 9.123 (1.50).
283	LC-MS (方法 L6): Rt = 0.81 min; MS (ESIpos): m/z = 534 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 9.05 (d, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.29 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.57 - 7.64 (m, 3H), 7.44 - 7.52 (m, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.11 - 7.20 (m, 1H), 6.87 - 6.95 (m, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.18 - 5.28 (m, 1H), 5.03 (d, 1H), 4.36 (br s, 1H), 4.27 (br t, 2H), 3.79 - 3.93 (m, 2H), 3.68 - 3.79 (m, 1H), 3.49 (br d, 1H), 2.12 - 2.24 (m, 1H), 1.97 - 2.10 (m, 2H), 1.89 (br d, 1H).
284	LC-MS (方法 L6): Rt = 0.82 min; MS (ESIpos): m/z = 534 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 9.05 (d, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.29 (d, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.57 - 7.65 (m, 3H), 7.45 - 7.51 (m, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.17 (t, 1H), 6.92 (t, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.22 (br d, 1H), 5.03 (d, 1H), 4.37 (br s, 1H), 4.20 - 4.31 (m, 2H), 3.68 - 3.91 (m, 3H), 3.51 (br d, 1H), 2.18 (br dd, 1H), 2.03 (br dd, 2H), 1.91 (br s, 1H).

[1892]

285	4.62	<p>¹H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.2548 (2.04); 9.2345 (2.1); 8.7855 (7.26); 8.3664 (2.02); 8.3479 (2.11); 8.3453 (2.18); 7.8787 (1.74); 7.8758 (1.94); 7.861 (2.47); 7.8581 (2.48); 7.7622 (1.94); 7.7414 (2.32); 7.7231 (1.43); 7.6547 (1.6); 7.377 (1.84); 7.3585 (1.98); 7.2033 (0.85); 7.1998 (0.91); 7.1823 (1.91); 7.1646 (1.15); 7.1615 (1.18); 6.9343 (1.34); 6.9157 (2.31); 6.8969 (1.1); 6.8176 (2.6); 6.7972 (2.33); 5.7568 (1.47); 5.3034 (0.53); 5.2897 (1.2); 5.2703 (1.21); 5.2561 (0.53); 4.2926 (1.27); 4.2792 (2.34); 4.2671 (1.8); 4.2581 (1.3); 4.2376 (0.33); 4.0706 (0.7); 4.0524 (2.63); 4.0345 (4.44); 4.0171 (4.89); 3.9996 (4.19); 3.9816 (2.38); 3.9627 (0.67); 3.6304 (3.62); 3.6065 (3.63); 3.3187 (31.43); 3.1462 (13.89); 2.6701 (0.58); 2.6659 (0.46); 2.5055 (77.14); 2.5012 (101.26); 2.4969 (75.96); 2.3321 (0.47); 2.3281 (0.61); 2.3241 (0.48); 2.2488 (0.44); 2.2418 (0.43); 2.2281 (0.71); 2.2163 (0.79); 2.2084 (0.75); 2.1941 (0.66); 2.1845 (0.36); 2.0978 (0.77); 2.0895 (0.89); 2.078 (0.63); 2.0643 (0.6); 2.0543 (0.57); 1.9886 (5.88); 1.3664 (0.32); 1.2071 (5.79); 1.1896 (12.06); 1.1762 (7.45); 1.1746 (7.59); 1.1724 (7.64); 1.1593 (11.84); 1.1417 (5.55); 0.0079 (0.56); -0.0002 (11.57)</p>
286	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.71 min, MS (ESIpos): m/z = 547 [M+H] ⁺	<p>¹H-NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.226 (1.29), 0.233 (4.30), 0.237 (4.63), 0.239 (4.52), 0.243 (4.88), 0.249 (1.40), 0.340 (1.52), 0.346 (4.07), 0.350 (4.50), 0.357 (4.85), 0.360 (3.44), 0.368 (1.04), 1.356 (1.85), 2.038 (0.54), 2.043 (0.74), 2.048 (0.90), 2.055 (1.09), 2.058 (1.29), 2.064 (1.93), 2.069 (2.31), 2.075 (2.90), 2.080 (1.94), 2.085 (1.35), 2.091 (0.59), 2.138 (0.52), 2.147 (0.75), 2.153 (0.91), 2.160 (1.03), 2.166 (0.97), 2.175 (0.71), 2.183 (0.72), 2.430 (0.61), 2.875 (2.56), 2.886 (5.07), 2.896 (2.59), 3.568 (1.55), 3.576 (3.52), 3.587 (3.45), 3.597 (1.35), 4.235 (0.44), 4.240 (0.64), 4.246 (0.51), 4.253 (1.67), 4.259 (1.50), 4.267 (2.05), 4.272 (2.07), 4.280 (1.42), 4.285 (1.84), 4.291 (0.49), 4.299 (0.60), 4.304 (0.43), 5.243 (0.77), 5.253 (1.54), 5.266 (1.49), 5.276 (0.69), 6.785 (2.94), 6.787 (3.06), 6.799 (3.15), 6.801 (3.19), 6.884 (1.60), 6.886 (1.58), 6.897 (3.02), 6.899 (2.96), 6.909 (1.78), 6.911 (1.69), 7.149 (1.45), 7.151 (1.48), 7.163 (2.43), 7.174 (1.26), 7.177 (1.19), 7.299 (2.47), 7.312 (2.33), 7.525 (2.41), 7.537 (2.93), 7.539 (2.68), 7.552 (2.48), 7.603 (2.71), 7.606 (5.93), 7.609 (4.64), 7.625 (16.00), 7.628 (11.38), 7.728 (0.51), 7.731 (0.49), 7.740 (3.43), 7.741 (3.45), 7.751 (2.98), 7.753 (2.90), 7.908 (1.67), 8.353 (2.70), 8.354 (2.72), 8.367 (2.61), 8.369 (2.48), 8.549 (9.74), 8.991 (2.87), 9.004 (2.73).</p>
287	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.98 min, MS (ESIpos): m/z = 548 [M+H] ⁺	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.52), 0.146 (0.53), 1.883 (0.77), 1.896 (0.94), 1.912 (1.02), 1.927 (1.11), 1.943 (1.13), 1.961 (0.80), 1.971 (1.04), 1.990 (1.32), 2.009 (0.93), 2.061 (1.59), 2.074 (1.40), 2.084 (1.11), 2.098 (1.33), 2.109 (1.05), 2.191 (2.00), 2.202 (1.93), 2.226 (1.16), 2.240 (0.86), 2.327 (0.57), 2.366 (0.54), 2.669 (0.58), 2.710 (0.53), 3.225 (0.66), 3.239 (1.63), 3.252 (3.85), 3.266 (3.91), 3.279 (2.86), 3.800 (0.70), 3.818 (1.59), 3.838 (1.38), 3.857 (0.53), 4.279 (3.25), 4.293 (5.39), 4.304 (3.56), 4.768 (1.59), 4.782 (3.24), 4.795 (1.56), 5.260 (0.71), 5.274 (1.51), 5.293 (1.51), 5.308 (0.71), 6.778 (2.68), 6.798 (3.02), 6.875 (1.45), 6.893 (3.03), 6.912 (1.75), 7.138 (1.46), 7.156 (2.35), 7.176 (1.18), 7.292 (2.47), 7.310 (2.24), 7.600 (1.83), 7.621 (2.91), 7.638 (16.00), 7.787 (3.16), 7.804 (2.53), 8.227 (2.56), 8.249 (2.35), 8.638 (8.70), 9.180 (2.48), 9.201 (2.46).</p>

[1893]

288	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.99 min; MS (ESIpos): m/z = 548 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.41), -0.008 (3.63), 0.008 (3.20), 0.146 (0.42), 0.853 (0.41), 1.235 (1.98), 1.571 (1.78), 1.770 (0.57), 1.783 (0.70), 1.800 (0.80), 1.813 (0.68), 1.832 (0.43), 1.896 (0.87), 1.916 (1.53), 1.934 (1.55), 1.951 (0.86), 1.997 (0.58), 2.004 (0.58), 2.018 (0.64), 2.032 (0.84), 2.105 (0.65), 2.117 (0.95), 2.135 (0.76), 2.149 (0.82), 2.172 (0.84), 2.185 (0.78), 2.193 (0.74), 2.206 (0.55), 2.327 (0.80), 2.366 (0.49), 2.523 (2.44), 2.665 (0.62), 2.669 (0.80), 2.709 (0.47), 3.168 (2.40), 3.202 (3.42), 3.235 (0.84), 3.730 (0.53), 3.748 (1.27), 3.769 (1.21), 3.787 (0.48), 4.172 (0.78), 4.196 (1.49), 4.202 (1.69), 4.217 (1.98), 4.233 (1.24), 4.246 (1.34), 4.252 (1.02), 4.262 (1.06), 4.273 (0.58), 4.281 (0.53), 4.775 (0.76), 5.232 (0.50), 5.246 (1.11), 5.266 (1.12), 5.280 (0.50), 6.792 (2.30), 6.813 (2.51), 6.929 (1.14), 6.946 (2.23), 6.964 (1.27), 7.169 (1.12), 7.173 (1.19), 7.190 (1.80), 7.208 (0.87), 7.409 (1.87), 7.427 (1.76), 7.603 (1.59), 7.622 (2.28), 7.625 (2.41), 7.637 (16.00), 7.651 (0.76), 7.789 (2.46), 7.804 (1.99), 8.208 (1.97), 8.227 (1.82), 8.554 (0.70), 8.654 (8.22), 9.267 (1.92), 9.288 (1.85).
289	LC-MS (方法 L4): Rt = 2.19 min; MS (ESI ^{neg}): m/z = 545 [M-H] ⁻	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.41), 0.853 (0.82), 0.936 (14.10), 0.967 (12.05), 0.979 (4.08), 1.010 (0.93), 1.091 (4.11), 1.112 (3.92), 1.128 (1.36), 1.141 (1.26), 1.209 (11.78), 1.226 (11.85), 1.257 (0.62), 1.863 (0.62), 2.038 (2.45), 2.070 (3.11), 2.086 (2.26), 2.124 (1.91), 2.137 (1.96), 2.328 (0.85), 2.366 (0.73), 2.524 (1.17), 2.670 (0.58), 2.711 (3.09), 3.066 (0.92), 3.075 (0.86), 4.217 (1.18), 4.236 (2.48), 4.254 (2.47), 4.264 (2.19), 4.277 (2.14), 4.296 (2.20), 4.323 (1.05), 5.256 (1.20), 5.271 (2.47), 5.288 (2.36), 5.754 (6.01), 6.779 (4.19), 6.800 (4.70), 6.850 (1.07), 6.869 (3.08), 6.886 (3.51), 6.904 (1.82), 6.921 (0.41), 7.137 (2.50), 7.155 (4.01), 7.173 (2.04), 7.246 (2.37), 7.268 (3.62), 7.289 (1.98), 7.527 (2.12), 7.546 (3.59), 7.566 (2.59), 7.595 (5.35), 7.599 (4.71), 7.629 (16.00), 7.633 (13.65), 7.755 (4.31), 7.772 (3.86), 8.153 (1.08), 8.195 (5.33), 8.334 (0.71), 8.562 (0.74), 8.585 (0.69), 8.632 (2.97), 8.640 (2.11), 8.653 (2.92), 8.664 (5.42), 8.676 (5.87), 8.916 (1.70), 8.935 (3.21), 8.955 (1.84), 8.981 (0.70), 9.001 (0.72), 9.015 (0.69), 9.035 (0.60), 9.091 (0.68), 9.148 (0.75).
290	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.50 min; MS (ESIpos): m/z = 548 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (1.02), -0.008 (8.92), 0.008 (8.60), 0.146 (1.00), 1.135 (7.45), 1.150 (7.45), 2.092 (0.86), 2.210 (0.77), 2.222 (0.70), 2.232 (0.75), 2.327 (1.38), 2.366 (0.75), 2.522 (3.76), 2.669 (1.31), 2.709 (0.68), 3.011 (0.88), 3.040 (1.40), 3.065 (1.22), 3.171 (0.86), 3.203 (2.49), 3.237 (1.13), 3.271 (0.95), 3.882 (0.86), 3.904 (1.86), 3.928 (2.90), 4.252 (1.18), 4.260 (1.02), 4.272 (1.81), 4.281 (1.77), 4.297 (0.97), 5.264 (1.11), 5.285 (1.13), 5.754 (6.81), 6.791 (2.20), 6.811 (2.42), 6.898 (1.09), 6.916 (2.17), 6.932 (1.24), 7.158 (1.11), 7.175 (1.77), 7.193 (0.88), 7.373 (1.83), 7.390 (1.67), 7.639 (16.00), 7.682 (1.45), 7.700 (2.08), 7.720 (1.88), 7.832 (2.51), 7.847 (1.92), 8.269 (2.08), 8.287 (1.92), 8.703 (7.92), 9.162 (1.99), 9.182 (1.90).
291	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.74 min; MS (ESI ^{neg}): m/z = 549 [M-H] ⁻	¹ H-NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.005 (0.51), 1.849 (0.72), 1.904 (0.43), 1.909 (0.44), 2.009 (0.42), 2.029 (0.63), 2.039 (0.75), 2.044 (0.67), 2.050 (0.81), 2.054 (0.88), 2.060 (0.72), 2.086 (1.13), 2.161 (0.42), 2.169 (0.75), 2.177 (0.71), 2.184 (0.86), 2.191 (0.78), 2.205 (0.57), 2.517 (0.75), 2.520 (0.73), 2.523 (0.59), 3.517 (0.55), 3.523 (0.43), 3.529 (0.50), 3.553 (0.60), 3.563 (1.79), 3.570 (1.96), 3.578 (0.98), 3.712 (0.61), 3.733 (0.80), 3.751 (0.73), 3.758 (0.72), 3.773 (0.86), 3.777 (1.00), 3.791 (1.38), 3.794 (1.30), 3.803 (1.20), 3.806 (1.23), 4.147 (0.64), 4.191 (0.42), 4.213 (0.68), 4.217 (0.52), 4.233 (0.62), 4.240 (1.21), 4.245 (0.85), 4.253 (2.20), 4.259 (2.32), 4.263 (2.48), 4.271 (1.51), 4.979 (0.68), 4.998 (0.65), 5.070 (0.63), 5.090 (0.60), 5.216 (0.57), 5.226 (1.21), 5.238 (1.18), 5.247 (0.54), 5.761 (0.76), 6.787 (2.54), 6.801 (2.68), 6.909 (1.25), 6.922 (2.41), 6.934 (1.36), 7.154 (1.22), 7.167 (1.95), 7.180 (1.02), 7.326 (1.05), 7.339 (1.97), 7.351 (1.01), 7.504 (1.06), 7.507 (1.14), 7.519 (2.23), 7.531 (1.20), 7.533 (1.22), 7.621 (16.00), 7.737 (2.63), 7.739 (2.75), 7.749 (2.42), 7.751 (1.17), 8.261 (2.15), 8.276 (1.14), 8.463 (4.46), 8.474 (4.71), 9.093 (1.35), 9.100 (1.40), 9.107 (1.41), 9.114 (1.26).

[1894]

292	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.92 min; MS (ESineg): m/z = 546 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (600 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.860 (0.57), 1.871 (0.77), 1.882 (0.62), 1.890 (0.44), 1.909 (0.41), 1.923 (0.56), 1.930 (0.52), 1.934 (0.70), 1.946 (0.52), 1.954 (0.72), 1.961 (0.49), 1.974 (0.44), 2.035 (0.45), 2.040 (0.47), 2.049 (0.93), 2.060 (0.97), 2.069 (0.59), 2.080 (0.42), 2.086 (1.00), 2.363 (0.46), 2.386 (0.48), 2.389 (0.45), 2.475 (0.54), 2.482 (0.97), 2.517 (1.22), 2.520 (1.25), 2.523 (0.53), 2.846 (0.43), 2.859 (0.55), 2.871 (0.67), 2.888 (0.55), 2.973 (0.59), 2.988 (0.60), 3.000 (0.43), 3.307 (0.67), 3.386 (0.42), 3.399 (0.44), 3.808 (0.49), 3.822 (0.49), 3.904 (0.48), 3.918 (0.47), 4.649 (0.59), 4.659 (0.66), 4.663 (0.57), 4.672 (0.44), 4.757 (0.59), 4.766 (0.67), 4.771 (0.55), 4.779 (0.49), 5.535 (0.60), 5.547 (0.59), 5.578 (0.65), 5.591 (0.64), 5.761 (4.08), 7.186 (0.77), 7.198 (0.64), 7.207 (0.58), 7.219 (1.00), 7.233 (0.76), 7.237 (0.74), 7.239 (0.73), 7.244 (1.42), 7.248 (0.86), 7.251 (0.95), 7.254 (1.18), 7.258 (1.17), 7.275 (0.96), 7.286 (0.49), 7.362 (0.89), 7.374 (0.74), 7.450 (0.61), 7.453 (0.66), 7.464 (0.59), 7.623 (0.42), 7.636 (0.92), 7.639 (2.00), 7.644 (16.00), 7.646 (12.97), 7.651 (1.35), 7.654 (1.10), 7.657 (1.10), 7.659 (0.98), 7.665 (0.95), 7.671 (0.88), 7.806 (1.15), 7.809 (1.53), 7.812 (1.33), 7.818 (1.12), 7.821 (1.26), 7.824 (0.95), 8.291 (0.84), 8.293 (0.83), 8.305 (0.81), 8.308 (0.78), 8.314 (0.95), 8.316 (0.95), 8.328 (0.80), 8.330 (0.76), 8.697 (6.20).
293	LC-MS (方法 L3): Rt = 4.24 min; m/z = 484/486 (M+1) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.911 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.22 (dd, J = 8.5, 1.4 Hz, 1H), 7.79 (dd, J = 7.1, 1.4 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.5, 7.1 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.21 - 7.14 (m, 1H), 6.97 - 6.88 (m, 1H), 6.80 (dd, J = 8.2, 1.1 Hz, 1H), 5.30 - 5.20 (m, 1H), 4.34 - 4.18 (m, 2H), 3.06 (s, 6H), 2.79 (s, 6H), 2.27 - 2.14 (m, 1H), 2.13 - 1.97 (m, 1H).
294	LC-MS (方法 L3): Rt = 3.20 min; m/z = 501/503 (M+1) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 5.910 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.19 (dd, J = 8.5, 1.5 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 7.1, 1.5 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.4, 7.1 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.22 - 7.12 (m, 1H), 6.97 - 6.88 (m, 1H), 6.86 - 6.76 (m, 3H), 6.
295	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.74 min; MS (ESipos): m/z = 532 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.900 (1.01), 1.909 (0.98), 2.019 (1.52), 2.030 (1.94), 2.148 (0.92), 2.162 (1.06), 2.178 (0.86), 2.194 (0.65), 2.389 (16.00), 3.169 (5.63), 3.232 (0.41), 3.305 (3.16), 3.314 (2.97), 3.479 (0.92), 3.506 (1.78), 3.533 (0.99), 3.711 (0.62), 3.734 (1.27), 3.755 (0.85), 3.789 (0.43), 3.811 (0.79), 3.829 (0.80), 3.845 (0.92), 3.856 (1.20), 3.866 (2.03), 3.879 (1.33), 3.894 (1.36), 3.905 (0.71), 4.165 (0.98), 4.256 (3.16), 4.374 (1.70), 5.034 (0.67), 5.214 (1.23), 5.226 (1.24), 6.773 (2.58), 6.793 (2.90), 6.882 (1.30), 6.901 (2.73), 6.919 (1.67), 7.135 (1.40), 7.156 (2.32), 7.174 (1.20), 7.296 (4.04), 7.311 (2.43), 7.323 (2.78), 7.424 (2.66), 7.441 (2.63), 7.460 (1.52), 7.478 (2.53), 7.499 (1.95), 7.614 (2.84), 7.632 (2.37), 8.137 (4.85), 8.291 (2.22), 8.313 (2.08), 8.357 (5.32), 9.028 (1.63), 9.032 (1.65), 9.048 (1.65).
296	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.34 min; MS (ESipos): m/z = 424 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.98), 0.008 (2.08), 3.063 (16.00), 4.243 (0.55), 4.262 (0.79), 4.270 (0.88), 4.283 (0.48), 5.248 (0.49), 5.268 (0.51), 6.785 (1.01), 6.805 (1.09), 6.905 (0.49), 6.923 (0.99), 6.939 (0.58), 7.150 (0.51), 7.167 (0.80), 7.348 (0.87), 7.366 (0.87), 7.378 (1.07), 7.396 (0.89), 7.428 (1.31), 7.447 (2.17), 7.465 (0.96), 7.574 (2.11), 7.591 (1.75), 7.595 (1.21), 7.614 (0.67), 7.632 (1.09), 7.652 (1.07), 7.697 (1.20), 7.701 (1.29), 7.715 (0.80), 7.719 (0.73), 8.174 (1.00), 8.177 (1.02), 8.195 (0.93), 8.199 (0.88), 8.583 (3.79), 9.068 (0.83), 9.088 (0.78).

[1895]

297		LC-MS (方法 L1): RI = 0.84 min; MS (ESIpos): m/z = 492 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.005 (0.54), 1.175 (0.51), 1.233 (0.88), 1.945 (0.48), 1.959 (1.35), 1.966 (0.68), 1.973 (1.44), 1.980 (1.50), 1.987 (0.67), 1.990 (0.61), 1.994 (1.45), 2.008 (0.53), 2.086 (2.18), 2.451 (0.53), 2.457 (0.63), 2.464 (1.16), 2.470 (1.43), 2.477 (1.47), 2.485 (1.96), 2.517 (0.87), 2.520 (0.88), 2.524 (0.72), 2.822 (0.63), 2.835 (1.18), 2.849 (1.35), 2.862 (1.68), 2.875 (0.78), 2.969 (1.03), 2.975 (1.07), 2.984 (1.12), 2.989 (1.08), 2.995 (0.85), 3.001 (0.81), 3.010 (0.76), 3.016 (0.67), 3.588 (0.86), 3.598 (2.43), 3.602 (2.62), 3.608 (3.14), 3.617 (1.76), 3.632 (0.42), 3.652 (3.34), 3.661 (4.14), 3.669 (1.71), 4.909 (0.68), 5.519 (0.77), 5.533 (2.21), 5.546 (2.18), 5.559 (0.73), 7.191 (0.82), 7.203 (2.41), 7.213 (3.76), 7.216 (3.96), 7.225 (2.72), 7.227 (2.72), 7.237 (1.21), 7.262 (3.11), 7.273 (1.90), 7.357 (2.79), 7.369 (2.30), 7.526 (2.39), 7.538 (2.98), 7.540 (2.73), 7.552 (2.48), 7.608 (2.68), 7.611 (5.84), 7.614 (4.57), 7.628 (15.29), 7.632 (11.06), 7.741 (3.49), 7.743 (3.42), 7.753 (3.14), 7.755 (2.91), 8.061 (1.26), 8.137 (16.00), 8.392 (2.82), 8.394 (2.80), 8.407 (2.71), 8.573 (9.90), 8.877 (2.88), 8.891 (2.74).
298		LC-MS (方法 L1): RI = 0.94 min; MS (ESIpos): m/z = 506 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.005 (0.41), 1.942 (0.52), 1.957 (1.44), 1.963 (0.74), 1.970 (1.55), 1.977 (1.60), 1.984 (0.73), 1.991 (1.56), 2.005 (0.56), 2.450 (0.57), 2.456 (0.67), 2.463 (1.22), 2.469 (1.51), 2.476 (1.48), 2.484 (1.77), 2.517 (0.76), 2.520 (0.73), 2.523 (0.57), 2.826 (0.69), 2.839 (1.33), 2.852 (1.51), 2.866 (1.87), 2.879 (0.87), 2.972 (1.15), 2.978 (1.19), 2.987 (1.24), 2.993 (1.19), 2.999 (0.94), 3.004 (0.89), 3.013 (0.85), 3.019 (0.75), 3.338 (3.68), 3.398 (0.51), 3.558 (0.53), 3.568 (2.60), 3.576 (6.35), 3.585 (4.12), 3.684 (1.95), 3.692 (4.19), 3.701 (3.62), 3.710 (1.33), 5.515 (0.84), 5.528 (2.43), 5.541 (2.41), 5.555 (0.80), 7.195 (0.86), 7.207 (2.64), 7.216 (3.91), 7.219 (4.26), 7.228 (2.98), 7.230 (2.96), 7.240 (1.27), 7.265 (3.39), 7.276 (2.07), 7.355 (2.95), 7.366 (2.41), 7.533 (1.96), 7.545 (2.81), 7.559 (2.13), 7.613 (4.94), 7.617 (4.00), 7.629 (16.00), 7.632 (10.79), 7.748 (3.54), 7.760 (3.14), 8.100 (1.02), 8.136 (6.62), 8.382 (2.78), 8.396 (2.64), 8.586 (8.69), 8.913 (2.35), 8.927 (2.27).
299		LC-MS (方法 L6): RI = 1.72 min; MS (ESIpos): m/z = 546 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm]= 11.89 (d, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.16 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.58 - 7.66 (m, 3H), 7.50 - 7.58 (m, 1H), 7.10 - 7.30 (m, 4H), 5.51 - 5.65 (m, 1H), 4.70 (br d, 1H), 3.95 (br d, 1H), 3.17 (br s, 1H), 2.76 - 2.99 (m, 2H), 2.30 - 2.43 (m, 3H), 1.88 - 2.08 (m, 4H).
300	2.6	LC-MS (方法 L1): RI = 1.14 min; MS (ESIpos): m/z = 546 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.060 (0.42), 2.066 (0.45), 2.075 (0.47), 2.088 (0.65), 2.094 (0.56), 2.183 (0.44), 2.193 (0.60), 2.203 (0.58), 2.210 (0.55), 2.443 (1.65), 2.460 (1.72), 3.126 (0.42), 3.139 (0.95), 3.155 (0.91), 3.168 (0.40), 3.453 (1.32), 3.468 (1.45), 3.473 (1.52), 3.487 (1.39), 3.880 (1.72), 3.887 (1.73), 3.902 (1.54), 3.909 (1.48), 4.231 (0.98), 4.237 (0.78), 4.247 (1.45), 4.254 (1.38), 4.268 (0.84), 4.653 (1.89), 4.662 (1.90), 5.254 (0.43), 5.266 (0.90), 5.281 (0.89), 6.781 (1.78), 6.797 (1.91), 6.891 (0.89), 6.906 (1.77), 6.921 (0.96), 7.149 (0.84), 7.152 (0.86), 7.166 (1.42), 7.180 (0.70), 7.389 (1.48), 7.403 (1.38), 7.651 (16.00), 7.694 (1.17), 7.708 (1.63), 7.725 (1.38), 7.846 (1.88), 7.859 (1.51), 8.297 (1.59), 8.313 (1.46), 8.833 (5.84), 9.232 (1.60), 9.248 (1.53).
301	3.3	LC-MS (方法 L1): RI = 1.21 min; MS (ESIpos): m/z = 576 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.006 (0.68), 2.065 (0.46), 2.072 (0.53), 2.084 (0.50), 2.093 (0.68), 2.099 (0.58), 2.106 (0.41), 2.204 (0.47), 2.213 (0.62), 2.222 (0.62), 2.230 (0.60), 2.518 (0.74), 3.356 (1.31), 3.379 (1.39), 3.420 (1.28), 3.443 (1.40), 3.759 (0.97), 3.785 (1.89), 3.799 (2.05), 3.813 (2.09), 3.819 (1.80), 4.030 (0.93), 4.054 (2.69), 4.066 (2.67), 4.084 (2.39), 4.108 (0.98), 4.252 (1.06), 4.258 (0.86), 4.268 (1.59), 4.275 (1.59), 4.288 (0.92), 5.257 (0.45), 5.269 (0.98), 5.284 (0.95), 5.295 (0.42), 6.789 (1.89), 6.805 (2.04), 6.916 (0.91), 6.931 (1.88), 6.946 (1.06), 7.155 (0.89), 7.158 (0.91), 7.172 (1.53), 7.186 (0.73), 7.396 (1.60), 7.410 (1.49), 7.641 (16.00), 7.674 (1.24), 7.688 (1.77), 7.705 (1.45), 7.813 (1.96), 7.815 (1.98), 7.827 (1.59), 8.614 (1.68), 8.631 (1.59), 8.696 (5.91), 9.169 (1.74), 9.186 (1.68).

[1896]

302		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.32 min; MS (ESIpos): m/z = 560 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ (ppm): 0.006 (1.48), 1.977 (2.45), 1.985 (3.20), 2.061 (0.94), 2.067 (1.00), 2.073 (1.28), 2.089 (1.37), 2.094 (1.18), 2.101 (0.84), 2.107 (0.62), 2.196 (0.68), 2.205 (1.01), 2.212 (1.42), 2.222 (1.44), 2.230 (1.70), 2.240 (1.49), 2.252 (3.88), 2.271 (3.21), 2.292 (0.43), 2.361 (0.59), 2.518 (1.55), 2.522 (1.14), 2.635 (0.56), 2.976 (2.42), 2.998 (2.58), 3.014 (2.43), 3.037 (2.48), 3.530 (3.55), 3.548 (2.59), 3.554 (3.28), 4.225 (0.63), 4.230 (0.76), 4.247 (2.09), 4.253 (1.54), 4.264 (1.81), 4.271 (1.84), 4.281 (1.90), 4.287 (1.63), 4.294 (1.74), 4.303 (0.69), 4.309 (0.76), 4.316 (0.55), 4.414 (3.03), 5.247 (0.90), 5.259 (1.92), 5.274 (1.85), 5.285 (0.82), 6.790 (3.65), 6.806 (3.88), 6.922 (1.77), 6.936 (3.59), 6.951 (2.00), 7.158 (1.76), 7.160 (1.81), 7.174 (2.97), 7.188 (1.47), 7.191 (1.38), 7.393 (3.10), 7.408 (2.87), 7.625 (10.72), 7.629 (16.00), 7.639 (5.39), 7.643 (5.55), 7.646 (2.39), 7.726 (0.54), 7.729 (0.50), 7.740 (2.23), 7.755 (3.44), 7.771 (2.93), 7.838 (3.90), 7.840 (4.07), 7.852 (2.90), 8.405 (3.15), 8.420 (2.90), 8.693 (11.68), 9.142 (3.37), 9.159 (3.24).
303	3.94		¹ H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.1897 (3.07); 9.1897 (3.08); 8.6999 (11.32); 8.267 (3.04); 8.2457 (3.34); 8.0999 (0.52); 8.0853 (0.45); 7.842 (3.13); 7.8244 (4.12); 7.72 (2.82); 7.6994 (3.57); 7.681 (2.24); 7.4668 (0.34); 7.4303 (0.34); 7.3979 (2.99); 7.3791 (3.33); 7.3415 (5.08); 7.3244 (4.63); 7.3196 (4.47); 7.3043 (1.56); 7.299 (1.58); 7.2806 (2.03); 7.2747 (2.74); 7.2519 (1.45); 7.1994 (1.49); 7.1795 (3.11); 7.1614 (1.93); 6.936 (2.19); 6.9174 (3.63); 6.8989 (1.79); 6.8126 (4.03); 6.7941 (3.62); 6.5851 (0.63); 6.5692 (0.59); 5.2851 (0.87); 5.2712 (1.94); 5.2526 (2.07); 5.238 (0.95); 4.3128 (0.7); 4.296 (1.79); 4.2741 (2.81); 4.253 (1.76); 4.2464 (2.03); 4.2239 (0.71); 3.9767 (2.68); 3.968 (2.61); 3.3189 (223.97); 3.2442 (2.16); 3.2141 (4.55); 3.1853 (2.46); 2.959 (1.92); 2.9418 (6.23); 2.9307 (3.17); 2.9237 (3.11); 2.9044 (1.79); 2.8953 (1.74); 2.6699 (3.71); 2.5052 (502.23); 2.5009 (661.81); 2.4966 (520.68); 2.3275 (3.85); 2.266 (0.88); 2.2232 (1.38); 2.2135 (1.48); 2.2008 (1.46); 2.1924 (1.27); 2.0867 (1.57); 2.0741 (1.82); 1.2862 (0.38); 1.2687 (0.48); 1.1687 (2.99); 1.1489 (14.24); 1.1439 (16); 1.1337 (15.75); 1.1285 (15.3); 0.9796 (0.37); 0.1461 (0.77); -0.0001 (185.99); -0.1498 (0.83)
304	4.03		¹ H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.1774 (0.67); 9.1576 (0.76); 8.5944 (2.4); 8.2724 (1.07); 8.2562 (1.18); 7.9525 (2.49); 7.7608 (0.4); 7.7376 (0.43); 7.7214 (0.76); 7.705 (2.49); 7.689 (1.82); 7.6851 (2.8); 7.6687 (1.86); 7.6537 (0.93); 7.5047 (0.32); 7.4854 (0.91); 7.4653 (1.16); 7.4546 (0.67); 7.4446 (1.44); 7.4361 (1.53); 7.4247 (0.93); 7.4155 (0.83); 7.3794 (1.2); 7.3566 (1.16); 7.3429 (0.88); 7.3272 (1.2); 7.3088 (0.58); 7.1857 (0.62); 7.1676 (1.13); 7.1481 (0.72); 6.9174 (0.63); 6.8992 (0.95); 6.8804 (0.48); 6.8023 (1.65); 6.7815 (1.43); 5.2499 (0.69); 5.2313 (0.63); 4.2592 (0.98); 4.2328 (0.72); 3.9863 (0.92); 3.3191 (221.03); 3.2639 (0.83); 3.2244 (0.64); 3.1788 (0.44); 2.9416 (2.82); 2.9215 (1.53); 2.8905 (16); 2.7311 (14.48); 2.6702 (3.3); 2.5232 (7.65); 2.5054 (445.22); 2.5012 (567.66); 2.497 (406.38); 2.3321 (2.56); 2.3276 (3.26); 2.2056 (0.52); 2.1956 (0.59); 2.1834 (0.61); 2.0737 (0.9); 1.1689 (1.1); 1.1501 (5.7); 1.135 (5.9); 0.1463 (0.73); 0.0077 (6.72); -0.0003 (158.9); -0.1492 (0.77)

[1897]

305	4.13		¹ H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.0348 (1.54); 9.027 (1.53); 9.0145 (1.71); 8.5999 (5.17); 8.5952 (4.9); 8.3156 (0.56); 8.2763 (2.51); 8.2726 (2.47); 8.2556 (2.81); 8.2518 (2.69); 7.761 (0.83); 7.7408 (1.05); 7.7366 (1.17); 7.7204 (1.9); 7.7118 (3.55); 7.7079 (3.89); 7.7027 (4.15); 7.6918 (4.33); 7.6878 (4.41); 7.6822 (4.39); 7.6687 (4.22); 7.6652 (4.79); 7.651 (2.14); 7.505 (0.9); 7.4854 (1.99); 7.4656 (2.95); 7.4594 (1.58); 7.4449 (3.55); 7.4401 (3.42); 7.4255 (3.77); 7.4152 (3.13); 7.3825 (1.69); 7.3796 (1.25); 7.3635 (1.11); 7.3418 (1.95); 7.3288 (2.47); 7.3136 (1.38); 7.2798 (1.9); 7.2633 (3.48); 7.2506 (1.55); 7.2324 (3.2); 7.2181 (3.48); 7.2031 (2.13); 7.1855 (0.81); 7.1649 (0.41); 7.1441 (0.33); 6.5786 (0.32); 5.5633 (0.47); 5.5512 (0.67); 5.5336 (1.2); 5.5215 (1.33); 5.5153 (1.19); 3.9908 (2.15); 3.6332 (0.34); 3.3942 (0.37); 3.3649 (0.63); 3.3197 (538.15); 3.2493 (2.06); 3.221 (1.81); 3.1926 (1); 3.1655 (0.46); 3.0162 (0.77); 2.9635 (3.49); 2.9414 (4.71); 2.9076 (2.72); 2.8901 (1.88); 2.8843 (2.04); 2.8632 (1.51); 2.8439 (1.23); 2.8236 (0.74); 2.761 (0.33); 2.7302 (1.28); 2.7155 (0.39); 2.6747 (4.3); 2.67 (5.87); 2.6656 (4.46); 2.6168 (0.41); 2.5905 (0.52); 2.5232 (16.08); 2.5054 (777.81); 2.501 (1009.77); 2.4966 (729.53); 2.4266 (0.57); 2.3322 (4.4); 2.3277 (5.87); 2.3234 (4.4); 2.2742 (0.35); 2.2675 (0.52); 2.2222 (0.32); 2.1718 (0.36); 2.105 (1.65); 2.0945 (1.09); 2.0739 (3); 1.9705 (0.53); 1.9506 (1.22); 1.9296 (1.19); 1.919 (1.2); 1.8967 (1.12); 1.8764 (0.43); 1.2914 (0.37); 1.2694 (0.4); 1.1687 (2.59); 1.1444 (16); 1.1291 (15.53); 1.0966 (0.51); 0.9654 (0.39); 0.1461 (1.27); 0.0078 (11.48); -0.0002 (299.28); -0.0082 (14.69); -0.1498 (1.31)
306	4.03		¹ H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.0457 (2.18); 9.0244 (2.21); 8.7059 (8.46); 8.3157 (0.33); 8.2677 (2.18); 8.2494 (2.31); 8.0868 (0.34); 7.8391 (2.16); 7.8242 (2.96); 7.7196 (2.12); 7.6988 (2.55); 7.6904 (1.63); 7.4555 (1.75); 7.4412 (2.02); 7.3429 (3.69); 7.3267 (3.62); 7.3056 (1.37); 7.2952 (1.61); 7.2766 (4); 7.26 (2.09); 7.2539 (1.54); 7.2464 (3.22); 7.2405 (3.62); 7.2316 (3.27); 7.2236 (2.72); 7.2048 (0.59); 7.1689 (0.57); 7.1519 (0.6); 7.1375 (0.42); 6.5782 (0.53); 5.5813 (0.59); 5.5623 (1.71); 5.5425 (1.78); 5.5244 (0.59); 3.9738 (1.83); 3.3197 (331.29); 3.2386 (1.56); 3.2294 (1.7); 3.2119 (1.9); 3.2003 (1.93); 3.0346 (0.53); 3.0265 (0.64); 3.0133 (0.66); 2.9954 (1.02); 2.9859 (1.13); 2.9726 (3.04); 2.9417 (5.18); 2.917 (2.47); 2.897 (1.7); 2.8769 (1.23); 2.8572 (0.9); 2.8366 (0.65); 2.7309 (0.37); 2.6701 (3.8); 2.5751 (0.52); 2.5672 (0.55); 2.5566 (1); 2.5452 (1.54); 2.5053 (506.49); 2.501 (657.35); 2.4967 (480.65); 2.355 (0.43); 2.3278 (3.92); 2.2456 (0.33); 2.2001 (0.4); 2.1674 (0.46); 2.0952 (0.44); 2.074 (1.44); 1.9927 (0.53); 1.9724 (1.13); 1.9617 (0.71); 1.9517 (1.18); 1.9397 (1.1); 1.9195 (1.05); 1.8986 (0.43); 1.2999 (0.38); 1.2692 (0.54); 1.1689 (3.6); 1.145 (16); 1.1296 (15.96); 1.1004 (0.93); 0.9694 (0.35); 0.1465 (0.88); 0.0077 (7.81); -0.0003 (197.85); -0.1495 (0.91)
307		LC-MS (方法 L3): Rt = 4.12 min; m/z = 501/503 (M+1) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.19 (dd, J = 8.5, 1.4 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 7.1, 1.4 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 8.5, 7.1 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.40 - 7.31 (m, 2H), 7.24 - 7.13 (m, 2H), 6.97 - 6.88 (m, 1H), 6.
308		LC-MS (方法 L3): Rt = 4.61 min; m/z = 535/537 (M+1) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.21 (dd, J = 8.5, 1.3 Hz, 1H), 7.78 (dd, J = 7.1, 1.3 Hz, 1H), 7.63 (s, 3H), 7.37 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.22 - 7.13 (m, 1H), 6.97 - 6.90 (m, 1H), 6.80 (dd, J = 8.2, 0.9 Hz, 1H), 5.30 - 5.
309		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.08 min; m/z = 564 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 8.49 (s, 1H), 8.31 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.67 - 7.60 (m, 2H), 7.44 - 7.31 (m, 2H), 7.25 - 7.11 (m, 2H), 6.90 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.23 (q, J = 6.0 Hz, 1H), 4.31 - 4.18 (m, 2H).

[1898]

310	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.26 min, m/z = 564/566 (C12 模式) (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.20 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.46 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.70 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.40 - 7.30 (m, 3H), 7.20 - 7.13 (m, 1H), 6.95 - 6.88 (m, 1H), 6.82 - 6.76 (m, 1H), 5.28 - 5.20 (m, 1H), 4.32
311	LC-MS (方法 L3): Rt = 4.51 min, m/z = 501/503 (M+1) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.17 (dd, J = 8.5, 1.4 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 7.1, 1.4 Hz, 1H), 7.67 - 7.58 (m, 2H), 7.51 (dd, J = 8.3, 2.1 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.21 - 7.12 (m, 1H)
312	LC-MS (方法 L3): Rt = 4.72 min, m/z = 453 (M+1) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.09 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.15 (dd, J = 8.3, 1.6 Hz, 1H), 7.67 - 7.56 (m, 2H), 7.36 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.21 - 7.10 (m, 2H), 6.96 - 6.89 (m, 1H), 6.83 - 6.77 (m, 1H), 6.75 - 6.68 (m, 2H), 6.58 - 6.52 (m, 1H), 5.6
313	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.43 min, m/z = 502 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.16 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.32 (m, 1H), 7.81 - 7.68 (m, 2H), 7.58 - 7.47 (m, 1H), 7.37 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.25 - 7.12 (m, 3H), 6.92 (m, 1H), 6.82 - 6.76 (m, 1H), 5.26 (q, J = 5.7 Hz, 1H), 4.26 (m, 2H), 3.88 (t, 1H)
314	LC-MS (方法 L2): Rt = 4.05 min, m/z = 602 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.23 (dd, J = 8.1, 4.6 Hz, 1H), 8.69 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.74 (dd, J = 8.1, 1.4 Hz, 1H), 7.56 - 7.41 (m, 1H), 7.40 - 7.23 (m, 2H), 7.17 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.99 - 6.86 (m, 1
315	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.80 min, m/z = 560 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.14 (dd, J = 8.1, 4.3 Hz, 1H), 8.60 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.45 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 9.1 Hz, 1H), 7.72 (dd, J = 8.1, 1.5 Hz, 1H), 7.48 - 7.40 (m, 1H), 7.37 - 7.27 (m, 2H), 7.15 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.93 - 6.87 (m, 1
316	LC-MS (方法 L3): Rt = 4.65 min, m/z = 526/528 (M+H)	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.15 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.20 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.87 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.67 (s, 3H), 7.36 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 7.21 - 7.14 (m, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.2, 1.1 Hz, 1H), 5.28 - 5.2
317	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.40 min, MS (ESIpos): m/z = 534 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (1.21), -0.008 (16.00), 0.008 (10.22), 0.146 (1.17), 1.679 (1.28), 1.768 (1.70), 2.062 (1.06), 2.328 (2.24), 2.367 (1.03), 2.524 (9.61), 2.671 (2.06), 2.711 (1.03), 3.648 (2.70), 3.664 (3.87), 3.681 (2.16), 3.818 (1.95), 3.833 (2.52), 3.851 (2.87), 4.262 (2.94), 4.451 (2.59), 5.176 (1.63), 5.755 (3.23), 6.818 (1.81), 6.837 (1.70), 6.894 (1.31), 7.193 (1.60), 7.294 (1.38), 7.620 (3.48), 7.628 (4.43), 7.672 (1.77), 7.692 (1.42), 7.833 (2.98), 7.865 (1.63), 7.970 (6.14), 8.217 (1.67), 8.234 (1.67), 8.477 (2.98), 8.881 (10.47), 9.374 (0.85).

[1899]

318	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.83), -0.008 (6.59), 0.146 (0.79), 1.156 (0.87), 1.175 (1.80), 1.192 (0.87), 1.235 (0.41), 1.660 (1.14), 1.679 (1.24), 1.690 (1.49), 1.710 (1.37), 1.903 (1.53), 1.988 (3.52), 1.999 (1.41), 2.012 (2.20), 2.028 (2.14), 2.048 (1.84), 2.068 (1.57), 2.165 (1.18), 2.181 (1.02), 2.197 (0.75), 2.327 (1.16), 2.366 (0.85), 2.393 (1.28), 2.411 (1.60), 2.428 (1.39), 2.669 (1.26), 2.709 (0.81), 3.162 (2.53), 3.175 (2.69), 3.381 (0.77), 3.408 (1.45), 3.421 (1.62), 3.440 (1.20), 3.467 (1.26), 3.483 (3.03), 3.494 (2.47), 3.510 (2.92), 3.528 (1.91), 3.676 (1.47), 3.697 (2.53), 3.716 (2.92), 3.724 (2.72), 3.742 (3.19), 3.768 (1.62), 4.020 (0.71), 4.038 (0.79), 4.073 (0.66), 4.087 (0.68), 4.172 (0.56), 4.254 (4.73), 4.264 (2.90), 4.717 (2.13), 4.729 (4.29), 4.742 (2.05), 5.193 (0.81), 5.207 (1.74), 5.226 (1.76), 5.240 (0.87), 5.754 (0.50), 6.777 (3.46), 6.797 (3.81), 6.896 (1.66), 6.913 (3.44), 6.931 (1.97), 7.144 (1.84), 7.161 (2.90), 7.180 (1.41), 7.319 (2.94), 7.338 (2.71), 7.477 (2.16), 7.496 (2.96), 7.517 (2.65), 7.606 (4.71), 7.610 (5.82), 7.619 (16.00), 7.623 (9.06), 7.711 (3.79), 7.727 (3.19), 7.873 (0.50), 8.267 (3.11), 8.288 (2.92), 8.442 (11.23), 9.024 (3.13), 9.044 (3.03).</p>	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 0.81 min, MS (ESIpos): m/z = 548 [M+H]⁺</p>		
319	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.062 (2.28), 2.197 (2.14), 2.209 (2.13), 2.218 (2.01), 2.327 (0.67), 2.670 (0.64), 3.876 (16.00), 4.213 (1.25), 4.234 (3.18), 4.254 (4.91), 4.262 (4.94), 5.244 (2.95), 5.261 (2.87), 6.776 (4.46), 6.796 (4.81), 6.893 (2.44), 6.911 (4.65), 6.930 (2.84), 7.142 (2.94), 7.161 (4.44), 7.179 (2.33), 7.351 (7.88), 7.369 (5.89), 7.391 (2.42), 7.416 (5.69), 7.423 (5.81), 7.435 (5.30), 7.454 (2.26), 7.537 (3.95), 7.553 (3.04), 7.629 (3.41), 7.645 (5.92), 7.671 (3.87), 7.691 (4.59), 7.709 (2.20), 8.265 (4.40), 8.285 (4.07), 8.575 (9.62), 9.149 (3.43), 9.168 (3.26).</p>	<p>LC-MS (方法 L6): Rt = 1.94 min, MS (ESIpos): m/z = 500 [M+H]⁺</p>		
320	<p>¹H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.006 (0.66), 0.006 (0.45), 0.992 (6.88), 1.006 (14.64), 1.020 (7.28), 1.175 (0.69), 1.914 (0.43), 1.921 (0.59), 1.928 (1.00), 1.935 (0.80), 1.941 (0.98), 1.949 (0.81), 1.963 (0.80), 1.975 (1.05), 1.988 (2.98), 1.999 (2.31), 2.015 (2.16), 2.027 (1.48), 2.044 (1.11), 2.050 (0.91), 2.056 (0.64), 2.169 (0.46), 2.176 (0.69), 2.186 (0.98), 2.196 (1.00), 2.204 (0.98), 2.214 (0.73), 2.221 (0.48), 2.363 (0.83), 2.379 (0.99), 2.392 (0.95), 2.407 (0.54), 2.519 (0.54), 3.335 (0.80), 3.347 (1.08), 3.351 (1.20), 3.361 (1.13), 3.375 (0.71), 3.865 (0.61), 3.878 (1.35), 3.895 (1.41), 3.903 (1.08), 3.911 (1.18), 3.917 (0.96), 3.925 (2.97), 3.936 (3.39), 3.939 (3.31), 3.950 (2.96), 3.957 (0.88), 3.964 (0.87), 3.972 (0.69), 4.173 (0.74), 4.201 (0.52), 4.206 (0.61), 4.223 (1.57), 4.229 (1.11), 4.240 (1.23), 4.246 (1.02), 4.259 (1.03), 4.266 (1.36), 4.272 (1.21), 4.279 (1.31), 4.288 (0.64), 4.294 (0.66), 4.301 (0.49), 4.604 (1.49), 4.615 (1.89), 4.621 (1.65), 4.631 (1.40), 5.243 (0.66), 5.254 (1.44), 5.270 (1.42), 5.281 (0.66), 5.754 (0.82), 6.792 (2.76), 6.807 (2.92), 6.809 (2.90), 6.925 (1.36), 6.927 (1.41), 6.940 (2.72), 6.942 (2.70), 6.955 (1.55), 6.957 (1.49), 7.168 (1.42), 7.171 (1.43), 7.185 (2.32), 7.199 (1.13), 7.201 (1.08), 7.397 (2.28), 7.411 (2.13), 7.636 (4.40), 7.639 (7.81), 7.642 (16.00), 7.645 (6.46), 7.653 (2.33), 7.667 (2.83), 7.670 (2.89), 7.684 (2.31), 7.725 (0.57), 7.729 (0.54), 7.819 (2.92), 7.822 (3.03), 7.834 (2.48), 7.836 (2.40), 8.343 (2.59), 8.345 (2.59), 8.360 (2.42), 8.362 (2.31), 8.680 (9.87), 9.196 (2.58), 9.212 (2.50).</p>	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 1.27 min, MS (ESIpos): m/z = 590 [M+H]⁺</p>		

[1900]

321	3.37		¹ H-NMR(399.953 MHz, CDCl ₃): δ = 9.1126 (4.72); 9.0958 (4.88); 9.0618 (1.78); 9.0408 (2.05); 8.1159 (0.51); 8.1073 (0.56); 8.0994 (0.58); 8.0917 (0.65); 8.0616 (0.48); 8.0511 (0.51); 8.0462 (0.52); 8.0366 (0.54); 7.9006 (1.45); 7.881 (1.8); 7.8347 (1.41); 7.8147 (2.11); 7.7661 (4.49); 7.761 (4.21); 7.7476 (6.54); 7.7434 (5.71); 7.7362 (3.9); 7.7155 (2.95); 7.6982 (1.01); 7.5821 (4.98); 7.5623 (5.73); 7.52 (0.37); 7.5044 (1.22); 7.4823 (1.25); 7.3467 (2.17); 7.3277 (5.49); 7.3079 (3.8); 7.2837 (3.47); 7.2612 (26.99); 7.2424 (6.4); 7.2359 (6.6); 7.2239 (5.17); 7.2163 (7.07); 7.1926 (3.1); 7.1696 (0.93); 6.9454 (1.11); 6.9262 (1.9); 6.9079 (0.91); 6.8815 (1.42); 6.8676 (6.02); 6.847 (7.37); 6.8332 (1.46); 6.8255 (2.03); 6.7513 (0.44); 6.7294 (0.44); 6.6499 (0.51); 6.6309 (0.48); 5.463 (0.52); 5.4511 (1.1); 5.4396 (1.55); 5.4277 (2.06); 5.4166 (1.59); 5.4055 (1.17); 5.3934 (0.57); 5.3772 (0.45); 5.3618 (0.93); 5.3447 (0.94); 5.3304 (0.42); 5.2987 (1.1); 4.345 (1.6); 4.327 (2.15); 4.3161 (2.64); 4.2918 (0.9); 4.284 (0.68); 4.2127 (0.88); 4.189 (2.02); 4.1633 (2.43); 4.1436 (2.4); 4.1261 (3.47); 4.1083 (3.64); 4.0904 (1.16); 3.2611 (13.51); 3.0936 (5.9); 3.0503 (1.6); 3.0032 (13.51); 2.9661 (13.47); 2.9245 (13.29); 2.3901 (0.54); 2.38 (0.86); 2.3661 (1.02); 2.3536 (1.63); 2.3427 (1.92); 2.3298 (1.66); 2.316 (1.68); 2.3065 (1.38); 2.2921 (0.68); 2.28 (0.49); 2.2702 (0.36); 2.1215 (1.79); 2.1092 (1.54); 2.1028 (1.49); 2.0868 (2); 2.0744 (1.46); 2.0598 (0.73); 2.041 (13.3); 1.5769 (18.97); 1.3654 (0.45); 1.3479 (0.92); 1.3301 (0.51); 1.2747 (3.51); 1.2568 (7.17); 1.239 (3.48); -0.0003 (15.15)
322		LC-MS (方法 L6): Rt = 2.26 min; MS (ESIpos): m/z = 550 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (1.57); -0.008 (16.00); 0.008 (12.28); 0.146 (1.64); 1.049 (0.50); 2.087 (0.63); 2.327 (3.21); 2.366 (2.46); 2.523 (10.58); 2.669 (3.09); 2.710 (2.46); 3.611 (1.20); 3.879 (3.72); 4.269 (1.01); 5.259 (0.69); 6.787 (1.26); 6.807 (1.51); 6.915 (0.76); 6.932 (1.39); 6.950 (0.76); 7.153 (0.76); 7.174 (1.13); 7.374 (1.20); 7.391 (1.89); 7.410 (1.26); 7.583 (1.70); 7.586 (2.08); 7.615 (1.70); 7.627 (1.95); 7.687 (1.95); 7.706 (1.26); 7.726 (1.32); 7.806 (1.45); 7.822 (1.32); 8.270 (1.39); 8.291 (1.20); 8.660 (4.66); 9.158 (1.20); 9.180 (1.13).
323		LC-MS (方法 L3): Rt = 2.90 min; m/z = 543/545 (M+1) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.19 (dd, J = 8.5, 1.3 Hz, 1H), 7.73 (dd, J = 7.1, 1.3 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.4, 7.2 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.22 - 7.12 (m, 1H), 7.09 - 6.97 (m, 3H), 6.97 - 6.87 (m, 1H), 6.
324		LC-MS (方法 L2): Rt = 2.91 min; m/z = 501/503 (M+1) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.51 (s, 1H), 8.17 (dd, J = 8.2, 1.7 Hz, 1H), 7.67 - 7.50 (m, 2H), 7.34 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.23 - 7.06 (m, 2H), 6.97 - 6.86 (m, 1H), 6.86 - 6.67 (m, 3H), 5.33 - 5.18 (m, 1H), 4.37 - 4.15 (m, 2H), 3.0
325		LC-MS (方法 L2): Rt = 3.19 min; m/z = 519/521 (M+1) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.20 (dd, J = 8.5, 1.3 Hz, 1H), 7.77 (dd, J = 7.1, 1.3 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 8.4, 7.2 Hz, 1H), 7.56 - 7.48 (m, 1H), 7.43 (dd, J = 13.3, 2.0 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.23 - 7.13 (m, 1H), 6.98 - 6.89 (m, 1H), 6.80 (dd, J = 8.2, 0.9 Hz, 1H), 5.31 - 5.20 (m, 1H), 4.35 - 4.18 (m, 2H), 3.06 (s, 6H), 2.86 (d, J = 2.3 Hz, 6H), 2.28 - 2.13 (m, 1H), 2.13 - 1.99 (m, 1H).
326		LC-MS (方法 L2): Rt = 2.86 min; m/z = 522 (C2 模式) (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.01 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.66 - 7.55 (m, 2H), 7.43 - 7.30 (m, 2H), 7.23 - 7.12 (m, 2H), 6.89 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.21 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.30 - 4

[1901]

327		LC-MS (方法 L2): Rt = 2.96 min, m/z = 522 (C2 模式) (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.01 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.49 (s, 1H), 8.25 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.62 – 7.54 (m, 2H), 7.34 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 7.19 – 7.12 (m, 1H), 6.95 – 6.87 (m, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.27 – 5.18 (m, 1H),
328	3.3		¹ H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.1516 (1.99); 9.1309 (2.07); 8.6957 (7.38); 8.3158 (0.74); 8.1756 (2.08); 8.1554 (2.33); 7.8284 (2.07); 7.8125 (2.84); 7.6916 (1.99); 7.6725 (2.46); 7.6445 (1.6); 7.5625 (0.42); 7.5064 (0.53); 7.4855 (0.5); 7.4369 (0.53); 7.3832 (2.2); 7.3653 (2.36); 7.1937 (1.06); 7.1767 (2.08); 7.1581 (1.32); 6.948 (1.5); 6.9294 (2.46); 6.9118 (1.23); 6.8712 (0.85); 6.8097 (2.74); 6.79 (2.61); 6.6398 (0.41); 6.5791 (0.42); 5.2663 (0.57); 5.253 (1.33); 5.2338 (1.23); 5.2205 (0.6); 4.3072 (0.46); 4.2867 (1.27); 4.2736 (2.25); 4.2461 (1.37); 4.2259 (0.44); 3.5335 (1.43); 3.5183 (3.51); 3.503 (2.16); 3.374 (2.24); 3.3585 (3.93); 3.3413 (2.21); 3.32 (177.93); 3.1924 (2.23); 3.1748 (4.03); 3.1575 (2.36); 3.0637 (15.58); 2.6707 (3.2); 2.5016 (591.34); 2.3283 (3.36); 2.2181 (0.84); 2.2067 (0.96); 2.1977 (0.96); 2.1833 (1.83); 2.1627 (2.11); 2.1422 (4.09); 2.1222 (2.63); 2.0859 (5); 1.7864 (0.63); 1.7681 (1.98); 1.7497 (2.66); 1.7307 (1.77); 1.3554 (7.89); 1.2706 (0.49); 1.2335 (0.35); 1.1856 (0.35); 1.1692 (2.96); 0.1462 (1.19); 0 (271.12); -0.1493 (1.3)
329		LC-MS (方法 L1): Rt = 0.80 min, MS (ESipos): m/z = 548 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.68), 0.008 (0.56), 1.686 (0.43), 1.705 (0.40), 1.908 (16.00), 1.988 (0.70), 1.999 (0.46), 2.012 (0.70), 2.030 (0.70), 2.047 (0.66), 2.057 (0.44), 2.409 (0.49), 2.523 (0.51), 3.409 (0.50), 3.478 (0.83), 3.496 (0.94), 3.503 (0.93), 3.520 (0.72), 3.689 (0.90), 3.707 (1.31), 3.722 (1.18), 3.740 (0.74), 3.746 (0.64), 3.764 (0.47), 4.234 (0.64), 4.242 (0.95), 4.254 (1.33), 4.730 (0.48), 5.206 (0.55), 5.225 (0.56), 6.778 (1.01), 6.799 (1.13), 6.895 (0.51), 6.912 (1.07), 6.931 (0.64), 7.142 (0.52), 7.145 (0.56), 7.163 (0.88), 7.180 (0.43), 7.184 (0.43), 7.322 (0.91), 7.341 (0.85), 7.478 (0.75), 7.496 (0.99), 7.499 (0.92), 7.517 (0.89), 7.601 (0.47), 7.606 (1.15), 7.610 (1.62), 7.618 (4.75), 7.622 (2.49), 7.709 (1.15), 7.712 (1.18), 7.727 (1.01), 7.729 (0.98), 8.139 (0.93), 8.258 (0.90), 8.261 (0.90), 8.280 (0.91), 8.440 (3.42), 9.025 (1.00), 9.046 (0.98).
330		LC-MS (方法 L6): Rt = 2.01 min, MS (ESipos): m/z = 510 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (1.17), 0.008 (0.88), 2.021 (0.41), 2.030 (0.47), 2.036 (0.52), 2.073 (1.14), 2.169 (0.52), 2.181 (0.50), 2.191 (0.48), 2.523 (0.76), 3.082 (16.00), 4.220 (0.74), 4.226 (0.64), 4.240 (1.18), 4.249 (1.20), 4.265 (0.72), 5.213 (0.69), 5.229 (0.68), 5.754 (1.51), 6.772 (1.38), 6.792 (1.55), 6.878 (0.73), 6.896 (1.52), 6.915 (0.91), 7.134 (0.75), 7.138 (0.79), 7.155 (1.26), 7.173 (0.63), 7.176 (0.61), 7.322 (1.30), 7.337 (1.39), 7.352 (0.91), 7.356 (0.87), 7.363 (0.63), 7.366 (0.62), 7.382 (0.84), 7.386 (0.81), 7.446 (0.76), 7.459 (0.83), 7.466 (1.28), 7.479 (1.28), 7.485 (0.72), 7.499 (0.63), 7.592 (1.03), 7.615 (1.76), 7.638 (1.08), 7.726 (1.39), 7.730 (1.40), 7.746 (1.23), 7.750 (1.17), 8.310 (0.92), 8.325 (1.02), 8.333 (0.99), 8.349 (0.90), 8.523 (2.23), 8.527 (2.23), 9.057 (0.86), 9.061 (0.87), 9.077 (0.86).

[1902]

331	3, 14		<p>¹H-NMR (399.9532 MHz, DMSO): δ = 9.1403 (1.94); 9.1288 (2); 9.1208 (2.32); 9.1103 (1.85); 8.6012 (10.54); 8.4715 (0.58); 8.3155 (1.57); 8.2143 (2.25); 8.1975 (2.56); 8.1729 (1.06); 7.7323 (2.07); 7.7127 (5.31); 7.6894 (10.46); 7.6737 (1.95); 7.4635 (1.67); 7.4521 (1.74); 7.4433 (2.94); 7.4332 (2.77); 7.4235 (2.08); 7.4143 (1.65); 7.3824 (1.86); 7.3618 (4.63); 7.3428 (4.44); 7.3225 (1.63); 7.1895 (1.81); 7.171 (3.64); 7.1535 (2.27); 6.9433 (2.6); 6.9255 (4.32); 6.9084 (2.02); 6.8059 (4.77); 6.7948 (4.45); 6.5782 (0.9); 5.2488 (1.97); 5.237 (2); 4.725 (1.91); 4.697 (7.04); 4.6722 (5.48); 4.6575 (5.6); 4.5955 (1.22); 4.5844 (1.61); 4.2921 (2.17); 4.2752 (3.94); 4.2675 (3.64); 4.2552 (2.23); 4.2471 (2.41); 4.2281 (0.89); 3.3183 (319.34); 3.2701 (0.87); 3.2496 (0.61); 3.1747 (0.71); 3.081 (1.6); 3.0759 (15.54); 2.9497 (1.08); 2.6703 (8.96); 2.5893 (0.63); 2.5051 (1239.6); 2.5012 (1583.24); 2.4971 (1204.24); 2.3276 (9.3); 2.2832 (0.88); 2.2475 (1.34); 2.2286 (1.72); 2.2205 (1.78); 2.1313 (0.96); 2.074 (5.92); 2.0168 (0.96); 1.2694 (0.87); 1.169 (4.47); 1.0034 (0.71); 0.9887 (0.75); 0.1463 (2.93); -0.0001 (642.47); -0.0792 (0.67); -0.1497 (3.13); -3.3083 (0.55)</p>
332		LC-MS (方法 L1): RI = 0.84 min; MS (ESI ^{pos}): m/z = 562 [M+H] ⁺	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.57), 0.146 (0.52), 2.063 (1.66), 2.099 (1.25), 2.118 (1.43), 2.130 (1.93), 2.149 (2.41), 2.167 (1.95), 2.220 (1.77), 2.233 (1.79), 2.251 (1.61), 2.263 (1.00), 2.327 (1.50), 2.366 (0.82), 2.669 (1.50), 2.710 (0.73), 3.195 (1.82), 3.214 (2.75), 3.232 (2.11), 3.670 (1.75), 3.682 (1.88), 3.727 (1.27), 3.745 (3.54), 3.768 (4.92), 3.788 (5.88), 3.807 (3.11), 3.831 (1.00), 4.241 (3.47), 4.252 (4.68), 5.212 (2.04), 5.232 (2.04), 6.779 (3.36), 6.799 (3.81), 6.894 (1.72), 6.912 (3.65), 6.931 (2.13), 7.147 (1.88), 7.164 (3.13), 7.182 (1.54), 7.329 (3.36), 7.347 (3.06), 7.522 (2.18), 7.542 (3.36), 7.562 (2.63), 7.623 (16.00), 7.742 (3.99), 7.759 (3.43), 8.257 (3.50), 8.277 (3.29), 8.501 (9.67), 9.095 (3.34), 9.115 (3.29), 12.559 (0.52).</p>
333		LC-MS (方法 L6): RI = 2.56 min; MS (ESI ^{pos}): m/z = 497 [M+H] ⁺	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.092 (0.76), 3.286 (3.16), 4.171 (16.00), 4.267 (1.78), 5.273 (1.01), 6.793 (1.51), 6.817 (1.83), 6.912 (0.84), 6.931 (1.63), 6.949 (1.01), 7.160 (0.88), 7.182 (1.36), 7.359 (1.40), 7.378 (1.33), 7.703 (1.10), 7.723 (1.64), 7.741 (1.31), 7.843 (4.97), 7.859 (4.94), 7.903 (1.82), 7.917 (1.37), 8.294 (1.60), 8.297 (1.77), 8.315 (1.52), 8.816 (5.70), 9.194 (1.47), 9.213 (1.36).</p>
334		LC-MS (方法 L7): RI = 2.60 min; MS (ESI ^{pos}): m/z = 477 [M+H] ⁺	<p>¹H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.007 (4.15), 0.007 (3.67), 1.235 (1.26), 1.395 (7.56), 1.409 (16.00), 1.423 (7.72), 1.950 (1.18), 1.966 (1.28), 1.975 (1.34), 1.991 (1.30), 2.522 (1.98), 2.853 (1.24), 2.869 (1.51), 2.885 (1.92), 2.901 (0.85), 2.981 (1.03), 2.989 (1.09), 2.999 (1.11), 3.006 (1.07), 3.013 (0.81), 3.286 (5.84), 4.352 (1.51), 4.354 (1.53), 4.366 (4.56), 4.368 (4.83), 4.390 (4.46), 4.383 (4.79), 4.394 (1.38), 4.396 (1.51), 5.533 (0.78), 5.549 (2.29), 5.564 (2.27), 5.580 (0.78), 5.754 (0.91), 7.227 (2.02), 7.231 (3.49), 7.238 (4.46), 7.245 (4.52), 7.249 (3.34), 7.260 (1.11), 7.278 (2.99), 7.290 (1.65), 7.294 (1.20), 7.400 (2.19), 7.406 (2.33), 7.417 (2.00), 7.654 (2.35), 7.658 (5.35), 7.661 (4.98), 7.674 (15.77), 7.678 (10.55), 7.714 (2.52), 7.729 (3.39), 7.731 (3.32), 7.745 (2.97), 7.889 (3.47), 7.891 (3.80), 7.903 (3.01), 7.906 (3.03), 8.304 (3.32), 8.307 (3.57), 8.321 (3.16), 8.324 (3.16), 8.842 (11.93), 8.998 (2.83), 9.015 (2.77).</p>

[1903]

335		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.42 min; MS (ESIpos): m/z = 507 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.09), 0.008 (1.03), 1.300 (13.37), 1.315 (15.22), 1.320 (15.14), 1.335 (13.44), 2.077 (1.40), 2.086 (1.14), 2.175 (0.96), 2.188 (1.01), 2.198 (1.11), 2.211 (0.97), 3.287 (1.40), 4.251 (1.94), 4.260 (2.90), 4.271 (3.78), 4.279 (2.28), 4.285 (1.96), 4.831 (0.79), 4.847 (2.11), 4.862 (2.86), 4.877 (2.07), 4.892 (0.76), 5.271 (1.74), 5.291 (1.73), 5.754 (1.60), 6.792 (2.95), 6.795 (3.21), 6.812 (3.38), 6.815 (3.52), 6.905 (1.65), 6.908 (1.68), 6.923 (3.35), 6.926 (3.31), 6.942 (2.06), 6.945 (1.96), 7.159 (1.66), 7.163 (1.75), 7.180 (2.64), 7.197 (1.36), 7.202 (1.34), 7.352 (2.66), 7.356 (2.66), 7.371 (2.57), 7.375 (2.32), 7.648 (1.92), 7.653 (4.51), 7.658 (3.68), 7.660 (16.00), 7.685 (11.73), 7.701 (2.83), 7.719 (3.62), 7.722 (3.32), 7.740 (3.41), 7.880 (3.80), 7.884 (4.07), 7.898 (3.21), 7.902 (3.13), 8.304 (3.63), 8.308 (3.69), 8.325 (3.41), 8.329 (3.23), 8.844 (13.48), 9.131 (3.03), 9.152 (2.95).
336		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.47 min; MS (ESIpos): m/z = 491 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (3.40), 0.008 (3.27), 1.234 (1.59), 1.255 (13.29), 1.270 (13.33), 1.324 (13.22), 1.339 (13.35), 1.958 (1.08), 1.976 (1.27), 1.988 (1.33), 2.008 (1.28), 2.517 (2.28), 2.849 (1.21), 2.869 (1.58), 2.889 (2.03), 2.908 (0.90), 2.981 (1.12), 2.992 (1.19), 3.003 (1.21), 3.013 (1.12), 3.288 (2.34), 4.795 (0.80), 4.810 (2.09), 4.825 (2.87), 4.841 (2.06), 4.856 (0.77), 5.539 (2.27), 5.558 (2.27), 7.221 (2.05), 7.226 (3.83), 7.234 (4.60), 7.243 (5.51), 7.248 (3.90), 7.261 (1.41), 7.266 (1.19), 7.275 (3.08), 7.289 (1.56), 7.297 (1.00), 7.402 (2.18), 7.409 (2.34), 7.423 (1.93), 7.651 (2.03), 7.656 (4.64), 7.661 (3.85), 7.682 (16.00), 7.687 (11.77), 7.702 (2.80), 7.720 (3.59), 7.723 (3.36), 7.741 (3.39), 7.879 (3.80), 7.883 (4.13), 7.897 (3.21), 7.901 (3.15), 8.305 (3.55), 8.309 (3.70), 8.326 (3.40), 8.330 (3.18), 8.861 (12.80), 8.984 (2.98), 9.004 (2.89).
337		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.54 min; MS (ESIpos): m/z = 517 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (3.13), 0.008 (3.33), 1.233 (0.81), 1.599 (1.35), 1.607 (1.77), 1.618 (2.67), 1.624 (2.67), 1.655 (1.41), 1.671 (1.41), 1.685 (1.17), 1.707 (0.97), 1.760 (1.28), 1.773 (2.47), 1.785 (3.62), 1.791 (3.70), 1.799 (3.24), 1.804 (3.14), 1.813 (3.40), 1.818 (3.25), 1.824 (2.52), 1.829 (2.47), 1.852 (1.86), 1.861 (1.79), 1.873 (1.75), 1.952 (1.31), 1.963 (0.89), 1.970 (1.48), 1.982 (1.57), 1.990 (0.88), 2.002 (1.52), 2.021 (0.70), 2.517 (2.37), 2.845 (1.39), 2.865 (1.83), 2.885 (2.35), 2.905 (1.05), 2.979 (1.28), 2.989 (1.38), 3.001 (1.41), 3.011 (1.32), 3.018 (0.95), 3.029 (0.85), 3.040 (0.83), 3.288 (1.16), 5.212 (1.44), 5.218 (2.09), 5.224 (2.42), 5.229 (2.21), 5.236 (1.36), 5.518 (0.92), 5.537 (2.66), 5.556 (2.65), 5.575 (0.92), 5.754 (1.62), 7.218 (2.33), 7.223 (4.35), 7.231 (4.99), 7.240 (6.10), 7.245 (4.34), 7.258 (1.57), 7.263 (1.32), 7.272 (3.57), 7.287 (1.82), 7.294 (1.20), 7.412 (2.53), 7.419 (2.76), 7.433 (2.33), 7.647 (1.83), 7.652 (4.58), 7.657 (3.89), 7.676 (16.00), 7.680 (11.73), 7.694 (2.99), 7.712 (3.95), 7.715 (3.80), 7.733 (3.62), 7.868 (4.03), 7.871 (4.39), 7.885 (3.41), 7.889 (3.40), 8.250 (3.81), 8.254 (4.05), 8.271 (3.65), 8.274 (3.52), 8.818 (13.85), 9.049 (3.54), 9.069 (3.47).
338		LC-MS (方法 L6): Rt = 2.62 min; MS (ESIpos): m/z = 523 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.69), 0.008 (1.48), 3.284 (16.00), 3.722 (1.56), 3.734 (2.60), 3.744 (1.75), 4.270 (1.58), 4.419 (0.92), 4.428 (1.44), 4.431 (1.39), 4.437 (1.43), 4.439 (1.46), 4.448 (0.90), 6.794 (1.04), 6.797 (1.09), 6.814 (1.20), 6.817 (1.20), 6.921 (1.21), 6.924 (1.15), 6.940 (0.75), 7.181 (0.92), 7.352 (0.93), 7.372 (0.91), 7.658 (1.44), 7.662 (1.50), 7.676 (5.94), 7.681 (3.69), 7.721 (0.99), 7.739 (1.31), 7.742 (1.17), 7.760 (1.24), 7.895 (1.40), 7.899 (1.44), 7.913 (1.18), 7.916 (1.10), 8.335 (1.30), 8.339 (1.31), 8.356 (1.25), 8.360 (1.14), 8.877 (4.74), 9.141 (1.07), 9.161 (1.04).

[1904]

339		LC-MS (方法 L6): Rt = 2.54 min, MS (ESIpos): m/z = 549 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.97), -0.008 (8.24), 0.008 (7.67), 0.146 (1.01), 1.147 (0.93), 1.750 (1.59), 1.915 (1.63), 2.075 (1.10), 2.204 (0.97), 2.366 (1.45), 2.669 (0.79), 2.710 (1.37), 3.287 (6.79), 3.337 (2.25), 3.366 (1.90), 3.390 (0.97), 3.865 (2.47), 3.895 (2.20), 4.253 (1.45), 4.282 (2.64), 4.748 (1.06), 4.758 (1.45), 5.272 (1.45), 5.292 (1.54), 6.795 (2.69), 6.798 (2.87), 6.815 (2.91), 6.818 (3.13), 6.910 (1.41), 6.913 (1.37), 6.929 (2.78), 6.932 (2.82), 6.948 (1.72), 6.951 (1.72), 7.165 (1.41), 7.169 (1.54), 7.189 (2.12), 7.208 (1.15), 7.387 (2.29), 7.407 (1.98), 7.652 (2.12), 7.657 (4.94), 7.661 (4.58), 7.678 (16.00), 7.683 (10.31), 7.725 (2.20), 7.742 (3.00), 7.746 (2.82), 7.764 (2.78), 7.894 (3.26), 7.898 (3.44), 7.912 (2.69), 7.916 (2.60), 8.366 (3.00), 8.370 (3.09), 8.387 (2.78), 8.391 (2.60), 8.852 (11.94), 9.170 (2.51), 9.191 (2.51).
340		LC-MS (方法 L6): Rt = 2.35 min, MS (ESIpos): m/z = 509 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.233 (1.46), 2.060 (1.17), 2.072 (1.22), 2.096 (1.85), 2.106 (1.52), 2.180 (1.45), 2.200 (1.60), 2.216 (1.38), 2.232 (1.09), 2.710 (0.59), 3.289 (2.29), 3.770 (2.50), 3.782 (6.45), 3.794 (6.45), 3.807 (2.58), 4.251 (3.09), 4.260 (3.55), 4.268 (6.08), 4.280 (3.73), 4.310 (0.75), 4.322 (1.11), 4.337 (3.05), 4.348 (6.79), 4.359 (6.81), 4.370 (2.86), 4.385 (0.96), 5.066 (2.32), 5.079 (4.75), 5.093 (2.23), 5.263 (1.21), 5.277 (2.42), 5.296 (2.39), 5.311 (1.08), 5.753 (12.22), 6.792 (4.39), 6.812 (4.98), 6.902 (2.47), 6.920 (4.70), 6.939 (2.63), 7.160 (2.23), 7.179 (3.73), 7.198 (2.03), 7.349 (3.82), 7.366 (3.59), 7.603 (0.66), 7.608 (0.74), 7.648 (2.33), 7.653 (5.18), 7.658 (5.13), 7.674 (16.00), 7.679 (12.12), 7.703 (2.84), 7.723 (4.62), 7.742 (3.57), 7.885 (3.87), 7.888 (4.97), 7.903 (3.20), 7.906 (3.94), 8.442 (3.94), 8.445 (4.43), 8.463 (3.83), 8.466 (4.03), 8.845 (14.44), 9.174 (4.04), 9.194 (3.96).
341		LC-MS (方法 L6): Rt = 2.64 min, MS (ESIpos): m/z = 493 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.356 (12.14), 1.405 (7.22), 1.423 (15.61), 1.441 (7.48), 2.073 (1.45), 2.082 (1.17), 2.091 (0.93), 2.183 (2.15), 2.192 (0.97), 2.203 (0.95), 3.568 (4.88), 4.247 (1.66), 4.256 (2.16), 4.268 (2.79), 4.274 (2.58), 4.283 (1.57), 4.359 (1.14), 4.366 (1.13), 4.377 (3.75), 4.383 (3.69), 4.394 (3.64), 4.401 (3.71), 4.412 (1.11), 4.418 (1.11), 5.274 (1.50), 5.294 (1.49), 6.793 (2.69), 6.796 (2.93), 6.814 (3.05), 6.817 (3.20), 6.871 (0.97), 6.908 (1.45), 6.911 (1.48), 6.927 (2.96), 6.930 (2.93), 6.946 (1.82), 6.949 (1.73), 7.160 (1.45), 7.165 (1.54), 7.182 (2.32), 7.199 (1.17), 7.203 (1.14), 7.352 (2.34), 7.372 (2.26), 7.376 (2.03), 7.650 (1.93), 7.655 (4.49), 7.659 (4.77), 7.672 (16.00), 7.677 (9.62), 7.709 (2.46), 7.727 (3.23), 7.730 (3.00), 7.748 (3.04), 7.888 (3.41), 7.891 (3.59), 7.905 (2.88), 7.909 (2.77), 8.301 (3.25), 8.305 (3.35), 8.322 (3.10), 8.326 (2.87), 8.833 (12.05), 9.137 (2.57), 9.158 (2.52).
342		LC-MS (方法 L6): Rt = 3.11 min, MS (ESIpos): m/z = 533 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.951 (16.00), 1.175 (0.88), 1.783 (0.75), 1.802 (1.29), 1.820 (0.77), 1.988 (1.34), 4.409 (0.73), 4.414 (0.72), 7.655 (0.81), 7.659 (0.83), 7.670 (2.53), 7.675 (1.64), 7.720 (0.69), 7.878 (0.71), 8.816 (2.01).
343		LC-MS (方法 L6): Rt = 2.84 min, MS (ESIpos): m/z = 557 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.37), 0.008 (1.76), 1.147 (1.15), 1.926 (1.02), 1.944 (1.15), 1.957 (1.15), 1.976 (1.22), 2.366 (1.63), 2.710 (1.69), 2.838 (0.95), 2.858 (1.29), 2.878 (1.69), 2.956 (0.88), 2.966 (1.02), 2.979 (1.02), 2.987 (1.02), 3.289 (3.66), 5.362 (7.73), 5.386 (8.00), 5.415 (0.75), 5.565 (2.03), 5.584 (1.97), 7.132 (0.88), 7.150 (2.37), 7.169 (1.69), 7.204 (1.97), 7.223 (4.00), 7.232 (2.03), 7.242 (1.97), 7.252 (1.29), 7.264 (3.53), 7.282 (1.69), 7.318 (2.24), 7.336 (4.81), 7.365 (1.76), 7.381 (2.98), 7.400 (2.92), 7.447 (1.15), 7.463 (1.76), 7.468 (1.97), 7.483 (2.10), 7.488 (1.29), 7.503 (1.08), 7.661 (1.56), 7.666 (3.80), 7.670 (4.95), 7.681 (16.00), 7.686 (9.15), 7.718 (2.51), 7.736 (3.19), 7.739 (3.12), 7.757 (3.05), 7.903 (3.39), 7.906 (3.80), 7.920 (2.92), 7.924 (2.98), 8.278 (3.12), 8.281 (3.46), 8.299 (3.05), 8.303 (2.98), 8.913 (11.73), 9.095 (2.71), 9.115 (2.71).

[1905]

344	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.84 min, MS (ESIpos): m/z = 575 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.235 (1.30), 1.935 (1.60), 1.954 (1.98), 1.965 (2.10), 1.986 (1.91), 2.005 (0.73), 2.672 (0.79), 2.711 (0.59), 2.843 (1.62), 2.863 (2.27), 2.884 (2.82), 2.904 (1.36), 2.969 (1.94), 2.982 (1.99), 5.450 (1.65), 5.478 (7.32), 5.493 (7.42), 5.522 (1.77), 5.546 (1.27), 5.563 (3.23), 5.583 (3.15), 5.601 (1.18), 7.146 (1.70), 7.164 (4.06), 7.182 (3.27), 7.207 (2.49), 7.224 (4.59), 7.242 (2.89), 7.264 (6.36), 7.282 (5.13), 7.311 (1.84), 7.392 (5.56), 7.410 (6.38), 7.434 (2.03), 7.473 (1.31), 7.495 (2.55), 7.518 (2.46), 7.540 (1.11), 7.665 (7.07), 7.680 (16.00), 7.706 (2.83), 7.724 (4.62), 7.744 (2.99), 7.898 (4.83), 7.916 (4.01), 8.213 (4.51), 8.234 (4.18), 8.918 (9.86), 9.128 (3.96), 9.147 (3.86).
345	LC-MS (方法 L6): Rt = 2.83 min, MS (ESIpos): m/z = 569 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.964 (0.76), 2.524 (1.70), 2.861 (0.81), 2.881 (1.06), 3.288 (1.25), 3.759 (16.00), 5.351 (4.36), 5.356 (4.34), 5.573 (1.21), 5.593 (1.19), 6.939 (1.06), 6.946 (1.14), 6.963 (1.25), 7.038 (1.56), 7.056 (4.26), 7.160 (1.59), 7.179 (1.19), 7.208 (0.94), 7.226 (1.85), 7.243 (1.17), 7.266 (2.21), 7.285 (1.11), 7.316 (1.26), 7.337 (1.99), 7.355 (1.09), 7.392 (1.78), 7.410 (1.52), 7.657 (1.23), 7.662 (2.51), 7.666 (2.55), 7.679 (7.30), 7.683 (4.89), 7.708 (1.19), 7.726 (1.75), 7.747 (1.41), 7.892 (1.85), 7.895 (1.92), 7.910 (1.52), 7.913 (1.46), 8.273 (1.73), 8.277 (1.74), 8.294 (1.66), 8.298 (1.55), 8.899 (5.35), 9.092 (1.61), 9.113 (1.58).
346	LC-MS (方法 L6): Rt = 1.65 min, MS (ESIpos): m/z = 518 [M-HCl+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.897 (1.03), 3.371 (1.10), 3.386 (1.01), 5.457 (1.45), 5.543 (1.27), 5.562 (1.29), 7.232 (1.04), 7.237 (1.87), 7.245 (2.18), 7.254 (2.72), 7.259 (2.05), 7.284 (1.61), 7.298 (0.86), 7.431 (1.08), 7.438 (1.17), 7.452 (1.00), 7.670 (16.00), 7.720 (1.27), 7.738 (1.69), 7.741 (1.59), 7.759 (1.49), 7.918 (1.80), 7.921 (1.89), 7.936 (1.57), 7.939 (1.51), 8.494 (1.49), 8.515 (1.46), 8.867 (5.92), 9.235 (1.48), 9.255 (1.44).
347	LC-MS (方法 L5): Rt = 1.39 min, MS (ESIpos): m/z = 549 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.166 (16.00), 2.055 (1.38), 2.069 (2.83), 2.084 (1.40), 2.873 (0.61), 2.889 (0.78), 3.108 (11.26), 4.418 (0.63), 4.433 (1.14), 4.447 (0.94), 4.460 (1.14), 4.474 (0.60), 5.544 (0.93), 5.560 (0.92), 7.215 (1.08), 7.226 (1.40), 7.230 (1.64), 7.243 (1.31), 7.257 (0.63), 7.273 (1.47), 7.287 (0.74), 7.417 (1.21), 7.432 (1.02), 7.647 (0.90), 7.651 (2.01), 7.654 (1.86), 7.670 (4.81), 7.674 (4.24), 7.701 (0.83), 7.717 (1.39), 7.732 (0.97), 7.875 (1.18), 7.877 (1.48), 7.889 (1.02), 7.891 (1.21), 8.314 (1.14), 8.316 (1.40), 8.331 (1.09), 8.333 (1.27), 8.809 (3.64), 9.077 (1.18), 9.093 (1.15).
348	LC-MS (方法 L6): Rt = 3.09 min, MS (ESIpos): m/z = 531 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.235 (2.39), 1.331 (1.53), 1.554 (1.87), 1.570 (3.23), 1.583 (3.23), 1.587 (3.23), 1.810 (1.44), 1.948 (0.98), 1.967 (1.15), 1.978 (1.21), 1.998 (1.12), 2.327 (0.78), 2.366 (1.18), 2.391 (1.44), 2.410 (1.90), 2.429 (1.44), 2.523 (3.83), 2.670 (0.81), 2.710 (1.10), 2.849 (1.01), 2.868 (1.33), 2.889 (1.90), 2.976 (0.95), 2.987 (1.07), 2.999 (1.01), 3.008 (0.98), 3.563 (4.90), 4.171 (1.21), 4.188 (1.44), 4.194 (3.17), 4.212 (3.11), 4.218 (3.26), 4.236 (3.11), 4.241 (1.53), 4.260 (1.15), 5.535 (2.02), 5.554 (1.96), 7.214 (2.13), 7.226 (2.80), 7.230 (3.14), 7.243 (2.57), 7.247 (2.80), 7.261 (1.53), 7.265 (1.27), 7.275 (3.06), 7.292 (1.38), 7.408 (2.42), 7.425 (1.96), 7.652 (1.99), 7.657 (4.73), 7.662 (5.19), 7.673 (16.00), 7.678 (9.23), 7.714 (2.36), 7.732 (3.11), 7.735 (2.85), 7.753 (2.88), 7.882 (3.20), 7.885 (3.57), 7.900 (2.74), 7.903 (2.68), 8.304 (3.11), 8.308 (3.23), 8.325 (2.91), 8.329 (2.77), 8.812 (11.70), 9.046 (2.62), 9.066 (2.51).

[1906]

349			LC-MS (方法 L5): RI = 1.37 min; MS (ESIpos): m/z = 490 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.997 (1.88), 1.009 (1.89), 1.256 (13.03), 1.268 (13.05), 1.324 (13.05), 1.337 (13.09), 1.963 (1.17), 1.978 (1.34), 1.987 (1.38), 2.004 (1.32), 2.514 (1.83), 2.523 (1.17), 2.852 (1.36), 2.868 (1.69), 2.884 (2.08), 2.900 (0.98), 2.986 (1.14), 2.995 (1.24), 3.004 (1.25), 3.012 (1.20), 3.018 (0.90), 3.027 (0.85), 4.801 (0.80), 4.813 (2.08), 4.825 (2.81), 4.837 (2.05), 4.850 (0.77), 5.526 (0.97), 5.541 (2.48), 5.557 (2.44), 5.571 (0.85), 7.222 (2.17), 7.227 (3.29), 7.233 (4.98), 7.241 (4.15), 7.245 (3.67), 7.256 (1.43), 7.260 (1.07), 7.274 (3.36), 7.287 (1.98), 7.291 (1.44), 7.404 (2.36), 7.408 (2.57), 7.420 (2.24), 7.649 (3.36), 7.652 (6.92), 7.656 (4.92), 7.681 (16.00), 7.685 (13.01), 7.704 (2.74), 7.718 (3.50), 7.720 (3.56), 7.735 (3.17), 7.878 (3.68), 7.881 (4.09), 7.892 (3.13), 7.895 (3.25), 8.306 (3.47), 8.309 (3.76), 8.323 (3.28), 8.326 (3.32), 8.861 (12.86), 8.984 (3.14), 9.001 (3.06).
350	5.06		LC-MS (方法 L1): RI = 1.35 min; MS (ESIpos): m/z = 477 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.303 (2.43), 1.322 (5.61), 1.341 (2.50), 3.252 (2.09), 3.271 (2.06), 4.250 (1.06), 4.259 (1.62), 4.268 (1.95), 4.275 (1.54), 4.284 (1.06), 5.305 (0.92), 5.325 (0.92), 6.783 (1.53), 6.785 (1.66), 6.803 (1.75), 6.806 (1.83), 6.911 (0.78), 6.914 (0.83), 6.930 (1.72), 6.932 (1.71), 6.948 (1.03), 6.951 (1.00), 7.149 (0.86), 7.153 (0.89), 7.170 (1.43), 7.350 (1.48), 7.370 (1.41), 7.652 (16.00), 7.752 (1.09), 7.770 (1.68), 7.791 (1.47), 7.871 (1.93), 7.874 (2.04), 7.889 (1.44), 7.892 (1.42), 8.319 (1.50), 8.322 (1.58), 8.340 (1.43), 8.343 (1.39), 8.839 (5.77), 9.102 (1.60), 9.123 (1.55).
351	5.1		LC-MS (方法 L1): RI = 1.36 min; MS (ESIpos): m/z = 471 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm]= 9.10 (d, 1H), 8.81 (s, 1H), 8.30 (d, 1H), 8.28 (br d, 1H), 7.71 - 7.84 (m, 2H), 7.46 (t, 1H), 7.30 - 7.40 (m, 3H), 7.12 - 7.22 (m, 1H), 6.93 (td, 1H), 6.79 (dd, 1H), 5.24 - 5.37 (m, 1H), 4.19 - 4.33 (m, 2H), 3.26 (q, 3H), 2.64 - 2.74 (m, 2H), 2.16 - 2.27 (m, 1H), 2.01 - 2.12 (m, 1H), 1.32 (t, 3H), 1.23 (t, 3H).
352			LC-MS (方法 L1): RI = 1.26 min; MS (ESIpos): m/z = 443 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm]= 9.08 (d, 1H), 8.82 (s, 1H), 8.25 (dd, 1H), 7.73 - 7.83 (m, 2H), 7.44 (s, 1H), 7.30 - 7.38 (m, 3H), 7.17 (t, 1H), 6.93 (t, 1H), 6.80 (d, 1H), 5.75 (s, 1H), 5.28 - 5.34 (m, 1H), 4.22 - 4.32 (m, 2H), 2.79 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.17 - 2.26 (m, 1H), 2.03 - 2.12 (m, 1H).
353			LC-MS (方法 L1): RI = 1.28 min; MS (ESIpos): m/z = 463 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.008 (0.60), 2.086 (0.58), 2.094 (0.47), 2.203 (0.46), 2.214 (0.45), 2.225 (0.41), 2.794 (10.72), 4.248 (0.87), 4.271 (1.29), 4.276 (1.30), 4.286 (0.77), 5.299 (0.74), 5.318 (0.76), 5.754 (1.41), 6.787 (1.44), 6.808 (1.54), 6.911 (0.70), 6.928 (1.45), 6.946 (0.85), 7.150 (0.73), 7.154 (0.77), 7.171 (1.18), 7.189 (0.58), 7.353 (1.24), 7.372 (1.13), 7.656 (16.00), 7.754 (1.00), 7.772 (1.46), 7.793 (1.32), 7.884 (1.64), 7.886 (1.70), 7.901 (1.28), 7.904 (1.19), 8.285 (1.42), 8.288 (1.42), 8.306 (1.32), 8.309 (1.24), 8.844 (4.54), 9.082 (1.27), 9.103 (1.21).
354			LC-MS (方法 L6): RI = 2.46 min; MS (ESIneg): m/z = 558 [M-H] ⁻	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (0.46), 0.008 (0.44), 1.175 (0.60), 1.187 (0.74), 1.193 (1.32), 1.205 (1.44), 1.211 (0.70), 1.223 (0.71), 2.073 (0.67), 2.523 (0.41), 3.168 (16.00), 4.201 (0.40), 4.218 (0.81), 4.227 (0.56), 4.236 (0.80), 4.245 (0.62), 6.804 (0.95), 6.826 (0.84), 7.683 (3.23), 7.697 (0.42), 8.001 (0.60), 8.018 (0.44), 9.111 (0.89), 9.124 (0.80).
355			LC-MS (方法 L1): RI = 1.25 min; MS (ESIpos): m/z = 488 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (3.59), 0.008 (2.29), 2.135 (0.68), 2.224 (0.56), 2.327 (1.51), 2.366 (1.57), 2.522 (5.91), 2.669 (1.22), 2.710 (0.80), 4.264 (1.54), 4.275 (1.87), 4.710 (5.79), 5.292 (0.89), 5.311 (0.86), 6.798 (1.54), 6.816 (1.69), 6.896 (0.83), 6.915 (1.63), 6.933 (0.95), 7.163 (0.83), 7.180 (1.34), 7.198 (0.65), 7.384 (1.40), 7.404 (1.25), 7.678 (16.00), 7.883 (1.10), 7.901 (1.66), 7.923 (1.51), 7.989 (2.02), 8.004 (1.40), 8.417 (1.57), 8.435 (1.45), 9.029 (5.19), 9.375 (1.45), 9.395 (1.34).

[1907]

356		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.41 min; MS (ESIpos): m/z = 491 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 9.12 (d, 1H), 8.83 (s, 1H), 8.33 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.72 - 7.79 (m, 1H), 7.65 (s, 3H), 7.36 (d, 1H), 7.14 - 7.22 (m, 1H), 6.93 (t, 1H), 6.80 (d, 1H), 5.25 - 5.37 (m, 1H), 4.20 - 4.34 (m, 2H), 3.17 - 3.26 (m, 2H), 2.20 (td, 1H), 1.99 - 2.11 (m, 1H), 1.64 - 1.78 (m, 2H), 1.02 (t, 3H).
357		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.39 min; MS (ESIpos): m/z = 489 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400MHz, DMSO-d6): δ [ppm]= 8.89 - 9.00 (m, 2H), 8.04 (d, 1H), 7.90 (d, 1H), 7.72 - 7.80 (m, 1H), 7.67 (s, 3H), 7.28 - 7.39 (m, 1H), 7.16 (t, 1H), 6.92 (t, 1H), 6.78 (d, 1H), 5.54 (s, 1H), 5.19 - 5.29 (m, 1H), 5.03 (br s, 1H), 4.17 - 4.33 (m, 2H), 2.11 - 2.28 (m, 4H), 2.02 (br s, 1H).
358	4.9	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.34 min; MS (ESIpos): m/z = 489 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.640 (1.22), 0.650 (1.42), 0.658 (1.28), 0.668 (0.69), 0.681 (0.74), 0.691 (1.29), 0.698 (1.52), 0.709 (1.18), 1.173 (1.12), 1.186 (2.68), 1.200 (2.43), 1.203 (2.55), 1.216 (0.95), 2.067 (0.40), 2.073 (0.54), 2.079 (0.80), 2.085 (0.85), 2.095 (0.95), 2.107 (1.22), 2.112 (1.05), 2.118 (0.74), 2.124 (0.52), 2.201 (0.53), 2.208 (0.81), 2.218 (1.13), 2.228 (1.10), 2.235 (1.08), 2.246 (0.78), 2.253 (0.54), 2.409 (0.51), 2.420 (1.04), 2.426 (1.14), 2.437 (1.81), 2.449 (1.05), 2.455 (1.00), 2.466 (0.59), 4.230 (0.57), 4.235 (0.67), 4.252 (1.84), 4.258 (1.37), 4.269 (1.59), 4.275 (1.46), 4.280 (1.41), 4.287 (1.66), 4.293 (1.43), 4.300 (1.50), 4.310 (0.60), 4.315 (0.65), 4.322 (0.46), 5.280 (0.80), 5.291 (1.74), 5.307 (1.69), 5.318 (0.75), 6.783 (3.28), 6.799 (3.54), 6.905 (1.59), 6.920 (3.31), 6.934 (1.85), 7.148 (1.91), 7.165 (2.68), 7.179 (1.30), 7.367 (2.83), 7.382 (2.86), 7.648 (16.00), 7.770 (1.92), 7.784 (3.02), 7.801 (2.71), 7.869 (3.37), 7.871 (3.35), 7.884 (2.52), 8.601 (2.89), 8.618 (2.72), 8.767 (0.65), 8.816 (9.10), 9.011 (2.78), 9.027 (2.65).
359		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.38 min; MS (ESIpos): m/z = 491 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.007 (1.53), 0.006 (1.15), 1.527 (11.61), 1.542 (11.90), 1.554 (11.58), 1.568 (11.39), 2.024 (0.41), 2.037 (0.85), 2.044 (0.90), 2.052 (0.94), 2.057 (0.92), 2.065 (1.24), 2.071 (1.06), 2.078 (0.75), 2.084 (0.55), 2.177 (0.52), 2.184 (0.80), 2.194 (1.16), 2.204 (1.11), 2.211 (1.11), 2.221 (0.74), 2.518 (0.93), 2.522 (0.72), 3.841 (0.48), 3.855 (1.08), 3.869 (1.42), 3.883 (1.05), 3.898 (0.42), 4.218 (0.51), 4.224 (0.67), 4.240 (2.00), 4.247 (1.53), 4.257 (2.08), 4.262 (2.36), 4.268 (1.99), 4.274 (1.55), 4.281 (1.68), 4.290 (0.52), 4.297 (0.62), 4.303 (0.43), 5.264 (0.80), 5.276 (1.75), 5.292 (1.70), 5.303 (0.77), 6.784 (3.41), 6.798 (3.68), 6.916 (1.72), 6.918 (1.66), 6.930 (3.46), 6.945 (2.02), 7.151 (1.65), 7.154 (1.69), 7.168 (2.77), 7.182 (1.36), 7.185 (1.32), 7.353 (2.85), 7.368 (2.66), 7.616 (12.83), 7.620 (16.00), 7.643 (4.67), 7.647 (6.31), 7.651 (2.84), 7.720 (2.36), 7.735 (3.26), 7.738 (2.76), 7.752 (2.91), 7.840 (3.95), 7.842 (3.95), 7.854 (3.15), 7.856 (2.93), 8.446 (3.04), 8.461 (2.92), 8.757 (12.10), 9.108 (3.03), 9.125 (2.93).
360		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.12 min; MS (ESIpos): m/z = 506 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (600 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.005 (1.55), 2.061 (0.52), 2.067 (0.77), 2.071 (0.86), 2.079 (0.95), 2.083 (0.89), 2.090 (1.10), 2.094 (0.95), 2.101 (0.63), 2.197 (0.52), 2.202 (0.70), 2.211 (1.08), 2.219 (1.07), 2.225 (1.08), 2.234 (0.81), 2.366 (0.48), 2.517 (1.21), 2.520 (1.17), 2.523 (0.96), 2.614 (0.48), 4.190 (1.43), 4.199 (0.87), 4.204 (1.08), 4.215 (5.45), 4.223 (1.99), 4.229 (4.83), 4.253 (1.43), 4.266 (1.08), 4.271 (1.32), 4.277 (1.21), 4.283 (1.51), 4.296 (0.76), 4.301 (0.61), 5.278 (0.77), 5.288 (1.58), 5.301 (1.57), 5.310 (0.71), 6.785 (3.04), 6.798 (3.20), 6.888 (1.54), 6.890 (1.54), 6.901 (3.04), 6.913 (1.75), 6.915 (1.67), 7.152 (1.45), 7.154 (1.49), 7.166 (2.44), 7.177 (1.22), 7.180 (1.20), 7.355 (2.91), 7.366 (4.77), 7.659 (8.30), 7.661 (16.00), 7.667 (5.88), 7.670 (4.36), 7.673 (1.81), 7.773 (2.24), 7.785 (2.96), 7.787 (2.70), 7.799 (2.65), 7.898 (3.37), 7.899 (3.46), 7.909 (2.76), 7.911 (2.71), 8.004 (2.52), 8.349 (2.84), 8.350 (2.88), 8.363 (2.68), 8.365 (2.58), 8.951 (10.28), 9.490 (2.95), 9.504 (2.84).

[1908]

361	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.44 min; MS (ESIpos): m/z = 474 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (0.70), 0.008 (0.49), 1.398 (16.00), 1.988 (0.45), 2.519 (0.43), 6.790 (0.48), 6.849 (0.44), 6.851 (0.45), 6.870 (0.51), 6.872 (0.48), 6.966 (0.40), 7.673 (0.41), 7.696 (4.12), 7.933 (0.43), 7.951 (0.60), 7.953 (0.54), 7.972 (0.53), 8.054 (0.67), 8.057 (0.62), 8.071 (0.49), 8.075 (0.41), 9.279 (0.96), 9.311 (0.50).
362	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.25 min; MS (ESIpos): m/z = 509 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (3.35), 0.008 (3.09), 1.942 (0.95), 1.962 (1.01), 1.973 (1.12), 1.994 (1.07), 2.877 (0.97), 2.897 (1.34), 3.072 (2.46), 3.089 (5.60), 3.105 (2.97), 3.287 (1.80), 3.448 (1.02), 3.452 (1.05), 3.463 (2.26), 3.469 (2.04), 3.479 (2.06), 3.483 (2.02), 3.500 (0.82), 4.961 (1.79), 4.975 (4.01), 4.989 (1.75), 5.573 (1.56), 5.593 (1.55), 5.754 (4.61), 7.226 (2.94), 7.234 (3.06), 7.240 (3.44), 7.248 (5.14), 7.258 (1.67), 7.266 (2.16), 7.276 (1.40), 7.279 (1.19), 7.511 (1.39), 7.523 (1.39), 7.533 (1.20), 7.657 (3.86), 7.659 (5.48), 7.663 (16.00), 7.667 (6.58), 7.670 (3.35), 7.673 (2.04), 7.676 (1.25), 7.683 (0.83), 7.839 (1.73), 7.857 (2.68), 7.860 (1.98), 7.879 (2.73), 7.927 (2.89), 7.931 (3.10), 7.945 (2.00), 7.949 (1.80), 8.630 (2.51), 8.634 (2.52), 8.651 (2.41), 8.655 (2.15), 8.879 (10.16), 9.027 (2.07), 9.048 (2.05).
363	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.37 min; MS (ESIpos): m/z = 558 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.58), 0.008 (2.57), 1.356 (1.00), 2.085 (16.00), 4.144 (1.13), 5.754 (1.90), 6.743 (1.76), 6.747 (2.04), 6.764 (1.98), 6.767 (2.24), 6.788 (1.04), 6.791 (1.01), 6.807 (2.03), 6.810 (1.93), 6.826 (1.26), 6.829 (1.15), 6.992 (1.32), 6.995 (2.52), 6.997 (1.59), 7.013 (1.50), 7.015 (2.62), 7.017 (1.66), 7.111 (0.95), 7.116 (1.01), 7.132 (1.62), 7.138 (1.65), 7.141 (1.44), 7.150 (2.04), 7.153 (2.12), 7.157 (1.66), 7.159 (1.41), 7.169 (1.40), 7.171 (1.37), 7.265 (1.54), 7.285 (1.54), 7.584 (1.21), 7.589 (1.25), 7.604 (1.61), 7.609 (1.64), 7.623 (1.04), 7.628 (1.04), 7.681 (0.99), 7.684 (1.64), 7.686 (2.60), 7.690 (5.09), 7.695 (12.74), 7.698 (4.45), 7.700 (3.56), 7.734 (1.72), 7.751 (2.14), 7.755 (2.02), 7.773 (2.10), 7.916 (2.37), 7.919 (2.53), 7.934 (2.01), 7.938 (1.93), 8.298 (1.27), 8.300 (1.54), 8.303 (1.59), 8.305 (1.45), 8.310 (1.37), 8.312 (1.59), 8.315 (1.49), 8.317 (1.32), 8.336 (2.29), 8.339 (2.36), 8.357 (2.07), 8.361 (1.99), 9.071 (8.31), 9.124 (1.92), 9.144 (1.88).
364	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.28 min; MS (ESIpos): m/z = 525 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.66), 0.008 (2.57), 2.119 (1.04), 2.128 (0.86), 2.366 (0.82), 2.710 (0.82), 3.060 (2.72), 3.077 (6.64), 3.093 (3.50), 3.287 (2.70), 3.438 (1.04), 3.454 (2.48), 3.468 (3.16), 3.481 (2.10), 3.497 (0.89), 4.254 (1.46), 4.263 (1.26), 4.273 (2.24), 4.282 (2.43), 4.297 (1.35), 4.946 (2.06), 4.960 (4.56), 4.974 (1.99), 5.291 (1.28), 5.310 (1.31), 6.781 (2.41), 6.784 (2.61), 6.802 (2.74), 6.805 (2.88), 6.910 (1.33), 6.913 (1.46), 6.928 (2.63), 6.932 (2.57), 6.947 (1.59), 6.950 (1.53), 7.151 (1.31), 7.156 (1.35), 7.173 (2.21), 7.190 (1.24), 7.194 (1.13), 7.448 (2.17), 7.465 (2.06), 7.627 (1.00), 7.632 (1.04), 7.658 (5.73), 7.662 (16.00), 7.666 (6.68), 7.669 (3.41), 7.675 (1.22), 7.638 (1.93), 7.856 (2.97), 7.859 (2.35), 7.877 (2.92), 7.929 (3.21), 7.932 (3.50), 7.946 (2.21), 7.950 (2.06), 8.624 (2.97), 8.627 (2.97), 8.645 (2.70), 8.649 (2.50), 8.881 (10.45), 9.155 (2.48), 9.175 (2.37).
365	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.32 min; MS (ESIpos): m/z = 507 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.150 (1.77), -0.008 (16.00), 0.008 (14.17), 0.146 (1.65), 1.236 (0.71), 2.104 (1.48), 2.217 (1.18), 2.327 (3.48), 2.366 (2.13), 2.523 (12.52), 2.669 (3.84), 2.709 (2.18), 4.249 (2.01), 4.269 (2.72), 4.297 (1.83), 5.284 (1.83), 5.303 (1.89), 5.754 (4.66), 6.784 (3.66), 6.804 (4.13), 6.917 (1.89), 6.932 (3.60), 6.951 (2.36), 7.155 (1.89), 7.173 (2.89), 7.193 (1.54), 7.357 (3.25), 7.362 (7.38), 7.366 (5.20), 7.394 (13.99), 7.398 (11.04), 7.430 (3.01), 7.447 (2.95), 7.814 (2.48), 7.832 (4.07), 7.853 (4.07), 7.892 (4.43), 7.896 (4.84), 7.910 (2.89), 8.550 (3.96), 8.554 (3.84), 8.571 (3.72), 8.575 (3.48), 8.841 (14.23), 9.114 (3.31), 9.135 (3.25).

[1909]

366	4.79	¹ H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.129 (0.47); 9.1148 (0.47); 9.1094 (0.47); 8.7855 (1.25); 8.7775 (1.27); 8.6377 (0.78); 8.6169 (0.83); 7.8685 (0.52); 7.8505 (0.85); 7.8295 (0.79); 7.7781 (1.03); 7.7634 (0.65); 7.7608 (0.66); 7.7301 (0.69); 7.7265 (0.81); 7.7101 (0.84); 7.7068 (0.92); 7.4773 (0.34); 7.4638 (0.65); 7.4576 (0.71); 7.4446 (0.66); 7.4301 (0.75); 7.4129 (0.41); 7.3928 (0.56); 7.3822 (0.55); 7.3662 (0.35); 7.1798 (0.35); 7.1614 (0.7); 7.1419 (0.43); 6.9335 (0.47); 6.915 (0.8); 6.8966 (0.39); 6.7926 (0.94); 6.7722 (0.84); 5.2907 (0.43); 5.2723 (0.45); 4.2863 (0.4); 4.2718 (0.77); 4.263 (0.76); 4.2526 (0.49); 4.2448 (0.48); 3.3189 (19.02); 3.0568 (0.38); 3.0385 (1.18); 3.0201 (1.27); 3.0017 (0.5); 2.5053 (32.31); 2.501 (45.79); 2.4969 (38.72); 1.3977 (16); 1.1703 (1.73); 1.1519 (3.55); 1.1335 (1.74); 0.0074 (1.2); -0.0002 (26.74)
367	5.48	¹ H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.1306 (2.01); 9.1101 (2.05); 8.8861 (7.98); 8.6333 (2.17); 8.6154 (2.23); 8.6122 (2.26); 7.9429 (1.75); 7.9397 (1.94); 7.925 (2.69); 7.9218 (2.64); 7.8638 (2.19); 7.8429 (2.42); 7.8248 (1.46); 7.6937 (0.7); 7.6622 (16); 7.458 (1.87); 7.4401 (1.96); 7.1926 (0.85); 7.1892 (0.9); 7.1715 (1.84); 7.1543 (1.13); 7.1505 (1.13); 6.948 (1.34); 6.9295 (2.26); 6.9106 (1.06); 6.8025 (2.51); 6.7834 (2.23); 6.5799 (0.36); 5.7548 (2.41); 5.3226 (0.52); 5.3079 (1.15); 5.2891 (1.14); 5.2746 (0.5); 4.3171 (0.37); 4.2984 (1.12); 4.2828 (2.04); 4.2742 (1.92); 4.2638 (1.11); 4.2555 (1.22); 4.2357 (0.36); 3.3221 (28.56); 3.0452 (1.38); 3.0269 (4.39); 3.0085 (4.61); 2.9901 (1.55); 2.9503 (2.63); 2.5062 (35.71); 2.5018 (49.01); 2.4975 (37.88); 2.2455 (0.37); 2.2396 (0.4); 2.2253 (0.63); 2.2154 (0.69); 2.2039 (0.74); 2.1923 (0.58); 2.183 (0.34); 2.1277 (0.35); 2.1193 (0.52); 2.1122 (0.71); 2.1045 (0.86); 2.0944 (0.61); 2.0876 (0.59); 2.078 (0.53); 2.0688 (0.48); 1.397 (6.52); 1.2337 (0.54); 1.1701 (1.44); 1.1529 (5.39); 1.1345 (11.03); 1.1161 (5.17); 0.0078 (2.03); -0.0002 (46.62)
368	3.76	¹ H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.4079 (0.91); 9.3936 (0.81); 9.3876 (0.93); 9.348 (0.54); 9.3284 (1.17); 9.3084 (0.7); 9.2139 (0.51); 9.2004 (1.18); 9.1877 (1.26); 9.1743 (0.63); 9.1376 (0.37); 9.124 (0.46); 9.1127 (0.45); 9.0815 (0.48); 9.069 (0.72); 9.0563 (0.54); 8.9299 (4.95); 8.9181 (2.18); 8.3146 (0.48); 7.8664 (6.67); 7.8446 (5.81); 7.8246 (0.32); 7.7421 (2.74); 7.7383 (2.93); 7.7222 (3.38); 7.7184 (3.39); 7.4976 (0.59); 7.4918 (1.24); 7.4783 (1.38); 7.4723 (2.72); 7.4633 (1.1); 7.4588 (1.07); 7.4523 (1.75); 7.4438 (0.68); 7.429 (1.04); 7.4219 (1.82); 7.4179 (1.54); 7.4031 (1.84); 7.399 (1.97); 7.3891 (1.42); 7.3854 (1.42); 7.38 (0.92); 7.3699 (1.26); 7.3497 (0.86); 7.3415 (0.86); 7.1887 (1.08); 7.1706 (2.27); 7.1526 (1.33); 6.9372 (1.41); 6.9184 (2.37); 6.8998 (1.11); 6.8025 (2.56); 6.782 (2.28); 5.7548 (16); 5.244 (0.78); 5.2248 (1.32); 4.3011 (0.47); 4.2715 (1.25); 4.2597 (1.64); 4.2386 (1.15); 4.2313 (1.34); 4.2105 (1.16); 4.19 (0.42); 4.0556 (0.74); 4.0378 (2.3); 4.02 (2.33); 4.0022 (0.78); 3.6324 (0.57); 3.6282 (0.47); 3.6193 (0.65); 3.6135 (1.07); 3.6005 (1.04); 3.595 (0.97); 3.5876 (0.71); 3.5816 (1.03); 3.569 (0.62); 3.5629 (0.59); 3.4779 (0.67); 3.3947 (0.75); 3.3771 (0.89); 3.3607 (0.77); 3.3457 (1.02); 3.3189 (76.03); 3.3011 (0.56); 3.2956 (0.52); 3.2762 (0.74); 2.6748 (0.91); 2.6703 (1.21); 2.6656 (0.94); 2.5235 (3.02); 2.5099 (69.23); 2.5056 (147.9); 2.501 (208.96); 2.4966 (158.74); 2.4924 (78.18); 2.3323 (0.85); 2.328 (1.2); 2.3235 (0.9); 2.2195 (0.41); 2.2066 (0.59); 2.1969 (0.68); 2.1869 (0.78); 2.1765 (0.84); 2.1662 (0.77); 2.1545 (0.61); 2.0945 (0.63); 2.085 (0.73); 2.0685 (0.72); 2.0511 (0.6); 1.9884 (9.96); 1.3946 (1.94); 1.3881 (1.89); 1.376 (4.14); 1.3695 (3.96); 1.3626 (3.1); 1.3577 (2.54); 1.3506 (2.19); 1.344 (5.38); 1.3253 (2.43); 1.1927 (2.64); 1.1749 (5.28); 1.1571 (2.56); 0.008 (1.98); -0.0001 (61.25); -0.0084 (2.3)

[1910]

<p>369</p>	<p>3.94</p>	<p>¹H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.2003 (2.67); 9.1806 (3.23); 9.167 (2.01); 9.0322 (8.51); 9.019 (6.5); 8.9438 (4.48); 8.9221 (4.91); 8.3143 (2.06); 7.9838 (3.69); 7.9659 (6.23); 7.9442 (6.22); 7.9065 (7.21); 7.889 (4.28); 7.7531 (5.21); 7.7495 (5.57); 7.7332 (6.28); 7.7295 (6.44); 7.508 (2.22); 7.4958 (2.14); 7.4896 (4.93); 7.4766 (4.41); 7.4689 (3.41); 7.4566 (5.08); 7.432 (6.44); 7.4078 (3.86); 7.3882 (1.78); 7.1782 (1.86); 7.1588 (3.64); 7.1396 (2.31); 6.9267 (1.91); 6.9158 (2); 6.908 (3.3); 6.8978 (2.95); 6.8915 (1.75); 6.8809 (1.36); 6.789 (5.67); 6.7684 (5.12); 5.7544 (10.27); 5.214 (1.39); 5.2001 (2.98); 5.1805 (2.91); 5.1675 (1.28); 4.305 (1.02); 4.2955 (1.49); 4.2776 (2.26); 4.2627 (2.39); 4.2546 (1.65); 4.2028 (1.82); 4.1938 (1.6); 4.1816 (2.42); 4.1738 (2.22); 4.1539 (1.1); 4.0375 (0.53); 4.0197 (0.62); 3.9026 (0.65); 3.7185 (0.69); 3.7005 (2.39); 3.6628 (6.64); 3.6642 (7.29); 3.6477 (3.14); 3.631 (1.2); 3.6135 (0.55); 3.5953 (0.33); 3.3784 (0.72); 3.3184 (262.18); 2.675 (3.55); 2.6703 (4.99); 2.666 (3.64); 2.5236 (12.22); 2.5055 (584.02); 2.5011 (819.49); 2.4967 (626.86); 2.3325 (3.45); 2.3279 (4.64); 2.3235 (3.47); 2.1791 (1.23); 2.1677 (1.59); 2.1578 (1.93); 2.1464 (2.45); 2.133 (2.65); 2.1234 (2.57); 2.0956 (1.25); 2.0828 (0.81); 1.9882 (2.46); 1.3887 (0.5); 1.3197 (7.73); 1.3046 (14.27); 1.301 (16); 1.2858 (7.08); 1.2826 (7.64); 1.2589 (1.64); 1.2352 (4.77); 1.193 (1.14); 1.1751 (1.98); 1.1573 (1.17); 1.1406 (0.7); 1.1176 (0.38); 1.0977 (0.35); 0.8541 (0.85); 0.8372 (0.72); 0.768 (0.51); 0.7585 (0.6); 0.7287 (0.37); 0.1458 (0.91); 0.0079 (6.73); -0.0002 (210.64); -0.0083 (8.7); -0.1499 (0.88)</p>
<p>370</p>	<p>4.44</p>	<p>¹H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.3994 (1.2); 9.3782 (2.63); 9.3572 (1.64); 9.1706 (1.25); 9.1482 (2.41); 9.1234 (1.62); 9.0407 (6.79); 9.0256 (5.14); 8.0137 (2.95); 7.9958 (3.69); 7.8636 (2.22); 7.8447 (3.05); 7.824 (1.78); 7.6865 (2.25); 7.6816 (5.53); 7.6774 (5.78); 7.6659 (16); 7.6613 (10.26); 7.4424 (1.15); 7.4242 (1.23); 7.3796 (1.54); 7.3615 (1.65); 7.1997 (1.27); 7.1795 (2.54); 7.1609 (1.67); 6.9491 (1.99); 6.9307 (3.38); 6.9119 (1.61); 6.8111 (3.75); 6.7907 (3.34); 5.7549 (6.05); 5.2713 (0.45); 5.2578 (1.23); 5.239 (1.43); 5.2251 (1.09); 5.2116 (0.34); 4.3107 (0.44); 4.3029 (0.54); 4.2848 (1.37); 4.2718 (2.3); 4.2635 (1.9); 4.2523 (1.39); 4.2444 (1.58); 4.2328 (0.73); 4.2244 (1.04); 4.217 (0.53); 4.2041 (0.33); 3.6141 (0.78); 3.6102 (0.99); 3.5958 (1.19); 3.5918 (1.15); 3.5813 (1.08); 3.5775 (1.52); 3.5627 (1.01); 3.5591 (1.28); 3.5409 (0.4); 3.3918 (1.1); 3.3729 (1.38); 3.3592 (1.03); 3.353 (1.23); 3.3401 (1.19); 3.3338 (1.2); 3.3202 (28.4); 3.3014 (0.76); 2.675 (0.44); 2.6707 (0.61); 2.6662 (0.47); 2.5235 (1.63); 2.5058 (73.82); 2.5014 (103.74); 2.497 (80.59); 2.493 (41.24); 2.3326 (0.43); 2.3281 (0.59); 2.3239 (0.48); 2.2328 (0.49); 2.2203 (0.71); 2.2113 (0.74); 2.1984 (1.03); 2.1872 (0.95); 2.1772 (0.91); 2.165 (0.61); 2.155 (0.35); 2.1416 (0.36); 2.1271 (0.7); 2.1187 (0.84); 2.1035 (0.67); 2.0935 (0.67); 2.0842 (0.76); 2.0783 (0.75); 2.0684 (0.55); 2.0605 (0.45); 2.0507 (0.37); 2.0437 (0.32); 1.3819 (3.75); 1.3633 (8.24); 1.3575 (3.82); 1.3445 (4.22); 1.3387 (6.43); 1.3199 (2.77); 1.2332 (0.72); 1.1754 (0.4); -0.0002 (0.66)</p>

[1911]

371	4.54	<p>¹H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 9.1895 (3.04); 9.1694 (3.1); 9.1296 (0.37); 9.1153 (10.56); 8.9396 (3.14); 8.9368 (3.35); 8.9178 (3.51); 8.915 (3.51); 8.3143 (0.49); 8.0499 (2.68); 8.0473 (2.89); 8.0321 (4.35); 8.0293 (4.1); 7.9727 (3.41); 7.9543 (2.73); 7.951 (3.52); 7.9328 (2.34); 7.7006 (3.22); 7.6959 (6.75); 7.6912 (4.54); 7.655 (16); 7.6503 (13.06); 7.4831 (2.66); 7.4649 (2.85); 7.1902 (1.31); 7.1863 (1.38); 7.1687 (2.79); 7.1515 (1.77); 7.1478 (1.69); 6.9385 (2.04); 6.9201 (3.47); 6.9036 (1.63); 6.9012 (1.66); 6.7982 (3.87); 6.779 (3.55); 5.7544 (1.92); 5.2344 (0.76); 5.2216 (1.73); 5.2018 (1.72); 5.1876 (0.75); 4.3164 (0.62); 4.3031 (0.84); 4.2899 (1.38); 4.2793 (1.29); 4.2738 (1.51); 4.2653 (1.02); 4.2225 (0.99); 4.2147 (1.33); 4.2016 (1.16); 4.1939 (1.75); 4.1864 (0.87); 4.1743 (0.72); 4.1658 (0.65); 3.7057 (0.34); 3.6883 (1.22); 3.6628 (1.08); 3.6702 (3.31); 3.6645 (3.08); 3.6516 (3.37); 3.6461 (3.16); 3.6329 (1.16); 3.6285 (1.24); 3.3193 (68.59); 2.675 (0.88); 2.6705 (1.18); 2.6659 (0.87); 2.5236 (3.14); 2.5101 (69.48); 2.5058 (144.19); 2.5013 (199.43); 2.4969 (149.23); 2.4928 (72.67); 2.3326 (0.83); 2.3282 (1.16); 2.3238 (0.81); 2.2169 (0.37); 2.204 (0.5); 2.1912 (0.95); 2.1785 (1.25); 2.1702 (1.47); 2.1564 (1.69); 2.1486 (1.83); 2.14 (1.59); 2.126 (0.94); 2.1147 (0.54); 2.1053 (0.46); 1.3515 (0.39); 1.3055 (7.28); 1.2869 (15.83); 1.2685 (7.21); 1.2352 (4.31); 1.17 (0.64); 1.1521 (0.57); 0.8536 (0.58); 0.835 (0.32); -0.0002 (1.18)</p>
372	4.08	<p>¹H-NMR(399.9532 MHz, DMSO): δ= 12.3602 (1.81); 9.1502 (2.55); 9.1301 (2.52); 8.892 (9.63); 8.8835 (0.49); 8.6271 (2.4); 8.624 (2.53); 8.6058 (2.71); 8.6028 (2.68); 7.9529 (2.14); 7.9502 (2.26); 7.9352 (3.25); 7.9323 (3.12); 7.9076 (0.43); 7.8737 (2.65); 7.8528 (2.81); 7.8346 (1.74); 7.6694 (8.23); 7.6663 (16); 7.4556 (2.26); 7.4372 (2.36); 7.1902 (1.1); 7.1719 (2.32); 7.1546 (1.4); 7.151 (1.4); 6.9475 (1.65); 6.9287 (2.79); 6.91 (1.31); 6.8025 (3.17); 6.7815 (2.81); 5.3004 (0.69); 5.2866 (1.49); 5.2669 (1.46); 5.2527 (0.64); 4.3167 (0.34); 4.3082 (0.53); 4.2896 (1.41); 4.2737 (2.43); 4.2645 (2.36); 4.2534 (1.28); 4.245 (1.54); 4.2252 (0.51); 4.2177 (0.4); 4.0377 (0.33); 4.0198 (0.37); 3.3181 (128.86); 3.1629 (2.73); 3.145 (6.07); 3.1272 (3.01); 2.89 (0.57); 2.7306 (0.51); 2.6743 (2.28); 2.6697 (3.09); 2.6658 (2.38); 2.615 (0.4); 2.597 (0.4); 2.5228 (8.93); 2.5052 (404.28); 2.5009 (529.51); 2.4965 (389.18); 2.477 (6.31); 2.332 (2.29); 2.3276 (3.04); 2.323 (2.27); 2.2559 (0.33); 2.2437 (0.53); 2.2366 (0.54); 2.2221 (0.88); 2.2127 (1.01); 2.2005 (0.98); 2.1892 (0.78); 2.1288 (0.69); 2.1204 (0.93); 2.1136 (1.11); 2.1049 (0.78); 2.0969 (0.76); 2.0877 (0.7); 2.0787 (0.66); 1.9883 (1.45); 1.2344 (0.51); 1.1925 (0.48); 1.1741 (0.82); 1.1569 (0.42); 1.1054 (0.4); 0.0077 (1.78); -0.0003 (53.99); -0.008 (2.53)</p>
373	LC-MS (方法 L1); R _t = 1.39 min; MS (ESIpos): m/z = 479 [M+H] ⁺	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 4.172 (16.00), 4.245 (0.90), 4.254 (1.07), 4.269 (1.49), 4.273 (1.51), 4.283 (0.86), 5.274 (0.83), 5.293 (0.83), 5.754 (12.35), 6.793 (1.40), 6.796 (1.53), 6.814 (1.59), 6.816 (1.66), 6.909 (0.74), 6.912 (0.74), 6.928 (1.55), 6.930 (1.54), 6.946 (0.93), 6.949 (0.91), 7.159 (0.76), 7.163 (0.82), 7.180 (1.29), 7.363 (1.33), 7.380 (1.25), 7.650 (0.88), 7.655 (2.07), 7.659 (2.33), 7.670 (7.40), 7.675 (4.39), 7.702 (1.20), 7.720 (1.66), 7.723 (1.57), 7.741 (1.47), 7.886 (1.69), 7.890 (1.80), 7.904 (1.44), 7.908 (1.42), 8.296 (1.61), 8.299 (1.63), 8.317 (1.54), 8.320 (1.45), 8.811 (5.57), 9.192 (1.36), 9.212 (1.34).</p>

[1912]

384	1.66	<p>384: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ= 8.973(10.6); 8.962(3(0.6)); 8.953(1(0.6)); 8.941(9(0.5)); 8.485(9(0.4)); 8.374(10(0.7)); 8.367(10(0.7)); 8.365(5(0.8)); 8.320(9(2.7)); 7.761(8(0.4)); 7.747(7(0.4)); 7.733(3(0.5)); 7.720(3(0.4)); 7.668(4(1.2)); 7.651(1(2.7)); 7.648(3(1.4)); 7.552(4(0.5)); 7.542(3(3.3)); 7.536(1(1.8)); 7.524(5(1.4)); 7.507(0.4); 7.433(3(0.4)); 7.422(8(0.5)); 7.413(8(0.9)); 7.403(3(0.8)); 7.394(1(0.6)); 7.387(1(0.5)); 7.304(6(1.3)); 7.286(2(1.8)); 7.271(1(0.5)); 7.167(8(0.5)); 7.147(1(1.7)); 7.128(0(6.6)); 6.908(6(0.8)); 6.889(1(2.6)); 6.871(13(0.6)); 6.785(1(1.6)); 6.765(4(1.3)); 5.247(9(0.3)); 5.233(8(0.7)); 5.214(0(0.7)); 4.257(3(1.1)); 4.244(1(1.8)); 4.231(4(1.1)); 3.321(7(36.1)); 3.062(2(2.2)); 3.056(2(2.8)); 3.050(4(2.7)); 3.043(9(2.5)); 3.027(8(0.6)); 2.504(9(33.4)); 2.500(7(44.2)); 2.496(5(34.0)); 2.173(6(0.3)); 2.152(1(0.4)); 2.138(0(6.2)); 2.124(1(0.5)); 2.031(2(0.5)); 2.016(3(0.6)); 2.003(8(0.3)); 1.994(7(0.4)); 1.988(4(0.4)); 1.397(1(16.0)); 0.000(2(19.8))</p>
385	1.55	<p>385: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ= 8.995(4(0.7)); 8.974(7(0.7)); 8.412(7(0.8)); 8.388(3(2.2)); 7.802(5(0.5)); 7.769(0(5.7)); 7.689(0(5.7)); 7.672(9(1.1)); 7.575(9(0.9)); 7.570(1(0.4)); 7.555(1(1.2)); 7.536(7(0.7)); 7.316(3(0.7)); 7.297(7(0.8)); 7.173(1(0.7)); 7.156(1(1.1)); 7.138(5(0.6)); 6.918(8(0.5)); 6.901(4(0.9)); 6.883(5(0.4)); 6.794(8(1.0)); 6.77(4.5(1.0)); 5.242(6(0.5)); 5.222(9(0.5)); 4.265(5(0.8)); 4.251(7(1.4)); 4.239(1(0.8)); 3.323(0(12.3)); 3.066(2(2.8)); 3.053(8(2.8)); 2.505(5(17.4)); 2.501(3(22.6)); 2.497(0(17.0)); 2.147(8(0.4)); 2.134(3(0.4)); 2.045(0(0.3)); 2.030(7(0.4)); 1.988(4(0.9)); 1.397(4(16.0)); 1.174(6(0.4)); 0.007(8(0.5)); 0.000(2(12.0))</p>
395	1.93	<p>395: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ= 8.982(5(3.1)); 8.962(3(2.1)); 8.448(4(2.1)); 8.433(4(2.3)); 8.424(5(2.4)); 8.410(3(12.6)); 8.328(8(0.6)); 7.929(2(1.8)); 7.916(5(1.8)); 7.658(3(3.8)); 7.653(2(7.4)); 7.648(4(2.7)); 7.532(2(4.2)); 7.509(5(4.5)); 7.488(4(2.4)); 7.462(8(11.2)); 7.459(4(10.8)); 7.319(2(0.3)); 7.306(5(2.9)); 7.287(9(3.1)); 7.177(3(1.4)); 7.173(1(1.4)); 7.153(1(1.4)); 7.138(1(1.9)); 7.135(3(1.8)); 6.919(2(0.2)); 6.916(4(2.2)); 6.900(1(3.6)); 6.897(9(3.8)); 6.881(9(1.8)); 6.879(2(1.8)); 6.796(1(4.0)); 6.794(0(4.1)); 6.775(3(7.7)); 6.773(5(3.6)); 5.755(9(16.0)); 5.247(7(0.8)); 5.233(0(1.9)); 5.213(4(1.9)); 5.199(7(0.9)); 4.261(8(3.1)); 4.248(6(5.4)); 4.235(6(3.4)); 4.037(9(0.4)); 4.020(2(0.4)); 3.321(8(6.0)); 3.066(1(11.7)); 3.053(6(11.8)); 2.674(9(0.6)); 2.670(5(0.8)); 2.666(0(0.6)); 2.523(8(2.8)); 2.510(3(50.5)); 2.506(0(102.1)); 2.501(5(134.9)); 2.497(0(97.8)); 2.492(7(47.7)); 2.332(8(0.6)); 2.328(2(0.8)); 2.323(7(0.6)); 2.191(6(0.4)); 2.178(0(0.9)); 2.162(7(1.0)); 2.157(4(0.9)); 2.142(4(1.6)); 2.128(9(1.5)); 2.114(9(0.6)); 2.054(9(0.5)); 2.042(5(1.3)); 2.028(0(1.5)); 2.020(5(0.8)); 2.015(0(0.9)); 2.006(9(1.1)); 1.988(7(2.2)); 1.397(3(10.5)); 1.351(6(0.5)); 1.258(7(0.4)); 1.249(2(0.3)); 1.233(3(0.9)); 1.192(6(0.5)); 1.174(8(1.0)); 1.157(0(0.5)); 0.008(0(1.2)); 0.000(1(34.0)); 0.008(4(1.3))</p>
427	3.81	<p>427: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ= 8.874(9(4.5)); 8.854(3(4.6)); 8.691(8(16.0)); 8.252(9(4.8)); 8.233(8(5.1)); 8.231(6(5.1)); 8.231(6(5.1)); 7.842(5(4.2)); 7.827(2(6.1)); 7.769(3(4.8)); 7.748(6(5.2)); 7.730(4(3.1)); 7.650(5(0.9)); 7.642(2(1.0)); 7.627(3(1.9)); 7.623(5(2.0)); 7.614(2(1.9)); 7.606(4(1.9)); 7.601(6(1.9)); 7.594(8(1.2)); 7.586(6(1.0)); 7.578(8(0.8)); 7.433(4(3.7)); 7.417(4(7.7)); 7.242(1(2.4)); 7.232(2(4.7)); 7.220(2(3.7)); 7.173(1(2.1)); 7.155(4(4.4)); 7.137(8(2.7)); 6.937(3(3.2)); 6.918(8(5.5)); 6.900(2(2.6)); 6.785(3(6.0)); 6.765(7(5.5)); 5.236(5(1.2)); 5.220(4(2.8)); 5.201(8(2.8)); 5.187(5(1.3)); 4.293(5(0.8)); 4.275(3(2.7)); 4.258(7(4.8)); 4.249(9(4.6)); 4.238(4(2.6)); 4.231(0(2.9)); 4.210(2(0.9)); 4.055(4(0.4)); 4.037(8(0.9)); 4.020(5(0.9)); 3.497(9(4.1)); 3.461(1(0.3)); 3.319(6(12.7)); 3.290(6(37.1)); 3.25(93(0.4)); 3.251(8(0.4)); 2.671(1(1.5)); 2.607(5(0.4)); 2.505(2(201.2)); 2.501(4(249.4)); 2.327(9(1.4)); 2.170(1(1.6)); 2.160(0(1.7)); 2.150(0(1.9)); 2.137(6(1.4)); 2.128(0(0.8)); 2.055(6(1.8)); 2.048(3(2.1)); 2.038(6(1.5)); 2.029(8(1.5)); 2.022(3(1.3)); 2.012(6(1.2)); 1.988(5(3.7)); 1.397(8(3.7)); 1.236(4(0.7)); 1.192(2(0.9)); 1.174(6(1.9)); 1.156(6(1.0)); 0.000(2(4.5))</p>
445	2.13	<p>445: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ= 8.415(4(0.6)); 8.412(3(0.6)); 7.682(3(0.4)); 7.678(6(0.4)); 7.657(1(0.4)); 7.647(5(0.4)); 7.640(0(0.9)); 6.763(7(0.4)); 5.752(4(16.0)); 4.064(5(0.6)); 3.872(4(0.6)); 3.320(2(8.2)); 2.505(2(4.9)); 2.500(8(6.3)); 2.496(3(4.5)); 2.320(5(0.4)); 1.988(0(0.7)); 1.175(2(0.4)); 0.000(2(4.8))</p>

[1914]

484	1.75	<p>484: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.0532(4.3); 9.0323(4.2); 8.5051(0.4); 8.4350(4.2); 8.4201(4.4); 8.4155(4.6); 8.3939(8.8); 8.3688(9.2); 8.3142(1.4); 7.6897(0.4); 7.6761(6.0); 7.6726(6.4); 7.6525(8.2); 7.6359(2.7); 7.6087(1.6); 7.5964(2.8); 7.5831(4.2); 7.5660(16.0); 7.5467(7.3); 7.5290(2.7); 7.4346(2.4); 7.4274(4.7); 7.4149(4.7); 7.3953(2.9); 7.3881(2.7); 7.3083(6.5); 7.3013(7.6); 7.2893(5.4); 7.1723(2.8); 7.1545(5.6); 7.1369(3.3); 6.9047(4.1); 6.8873(6.8); 6.8693(3.2); 6.7945(7.5); 6.7740(6.8); 6.5258(1.6); 6.5249(3.5); 6.5226(3.4); 6.5210(3.1); 6.5203(1.5); 4.7025(4.2); 4.6839(6.9); 4.6682(6.4); 4.6465(2.6); 4.6386(2.2); 4.3431(1.0); 4.3325(1.0); 4.2970(6.9); 4.2829(10.8); 4.2688(9.9); 4.2575(8.7); 4.2461(5.4); 4.2278(0.8); 4.0556(1.0); 4.0378(3.1); 4.0200(3.2); 4.0022(1.1); 3.7921(5.4); 3.7775(6.0); 3.7605(5.6); 3.4061(10.4); 3.3209(633.3); 3.2515(0.4); 2.6703(5.2); 2.5056(663.0); 2.5013(852.3); 2.4971(645.4); 2.3840(0.4); 2.3324(3.9); 2.3280(5.2); 2.3082(0.4); 2.1919(0.8); 2.1797(1.6); 2.1597(1.9); 2.1448(2.9); 2.1293(2.4); 2.1159(1.1); 2.0312(2.3); 2.0180(2.4); 1.9883(14.6); 1.2981(0.3); 1.2593(0.4); 1.2345(1.1); 1.1926(3.6); 1.1748(7.1); 1.1570(3.5); 1.0448(6.4); 1.0295(6.3); 0.8540(0.3); 0.0078(1.1); -0.0002(31.7)</p>
485	4.61	<p>485: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.0447(1.3); 9.0241(1.4); 8.6831(5.0); 8.3580(0.9); 8.3422(1.0); 8.3344(1.0); 8.3188(1.0); 7.6986(1.6); 7.6939(3.0); 7.6892(1.8); 7.6815(1.1); 7.6582(1.9); 7.6350(1.0); 7.5067(4.9); 7.5025(4.7); 7.4296(0.9); 7.4176(1.1); 7.4087(1.0); 7.2865(0.5); 7.2766(0.9); 7.2645(1.5); 7.2529(0.7); 7.2405(2.7); 7.2354(1.7); 7.2291(1.7); 7.2245(1.3); 7.2186(1.6); 5.5624(0.4); 5.5433(1.1); 5.5237(1.1); 5.5041(0.4); 3.8775(2.7); 3.8671(4.2); 3.8565(2.8); 3.5679(2.1); 3.3194(17.3); 3.2870(3.4); 3.2784(3.4); 3.0030(0.3); 2.9938(0.4); 2.9651(0.5); 2.9765(0.6); 2.9634(0.6); 2.9552(0.5); 2.9048(0.4); 2.8945(0.9); 2.8646(0.7); 2.8450(0.5); 2.6708(0.5); 2.6662(0.4); 2.5661(0.3); 2.5564(0.6); 2.5453(0.8); 2.5356(1.0); 2.5237(2.6); 2.5059(67.0); 2.5015(85.5); 2.4972(64.1); 2.3327(0.4); 2.3285(0.5); 2.3238(0.4); 1.9882(1.2); 1.9554(0.6); 1.9449(0.3); 1.9351(0.6); 1.9237(0.6); 1.9042(0.6); 1.3978(16.0); 1.1752(0.6); -0.0002(3.5)</p>
486	2.63	<p>486: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.3542(5.2); 9.3302(5.6); 9.1745(3.3); 9.1546(3.4); 8.5530(16.0); 8.4199(3.0); 8.4043(3.3); 8.3963(3.5); 8.3808(3.2); 8.1903(5.9); 8.1702(6.4); 7.7341(3.5); 7.7112(6.5); 7.6943(2.1); 7.6878(5.3); 7.6762(3.0); 7.6661(2.0); 7.6563(1.7); 7.5069(2.7); 7.4864(3.7); 7.4659(2.1); 7.3456(4.0); 7.3267(4.4); 7.1685(2.0); 7.1506(4.3); 7.1329(2.6); 7.1302(2.5); 6.9072(3.0); 6.8889(5.2); 6.8703(2.4); 6.7892(5.9); 6.7690(5.4); 6.5571(1.2); 6.5415(2.6); 5.2224(2.7); 5.2081(1.2); 4.2961(1.0); 4.2873(1.0); 4.2804(0.9); 4.2686(1.0); 4.2592(2.3); 4.2526(2.8); 4.2429(3.4); 4.2350(2.7); 4.2211(2.2); 4.2140(2.8); 4.1933(1.0); 4.1864(0.8); 4.0381(0.5); 4.0204(0.5); 3.8901(13.8); 3.8786(6.0); 3.8613(1.1); 3.3619(1.0); 3.3512(1.8); 3.3217(5.1); 3.3073(9.9); 3.2947(4.6); 3.2752(1.7); 3.2647(1.0); 2.6702(0.9); 2.6662(0.7); 2.5404(3.4); 2.5054(14.7); 2.5012(147.6); 2.4969(111.5); 2.3277(0.9); 2.2413(0.6); 2.2284(0.9); 2.2203(1.2); 2.2072(1.7); 2.1979(1.7); 2.1856(1.8); 2.1736(1.3); 2.1643(0.8); 2.0621(1.2); 2.0540(1.7); 2.0471(1.9); 2.0314(1.4); 2.0198(1.3); 2.0125(1.2); 2.0049(0.8); 1.9975(0.6); 1.9883(2.2); 1.2586(0.4); 1.2350(0.4); 1.1927(0.6); 1.1749(1.1); 1.1589(5.2); 1.0697(4.9); 1.0455(0.4); 1.0301(0.4); 0.1459(0.7); 0.0073(6.8); -0.0002(147.2); -0.1497(0.8)</p>
490	2.96	<p>490: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.1477(4.1); 9.1276(4.1); 8.5827(12.2); 8.3171(2.9); 8.3016(3.0); 8.2939(3.1); 8.2782(2.8); 7.9206(2.2); 7.6395(3.1); 7.6171(5.3); 7.5945(2.9); 7.3628(2.2); 7.3551(2.4); 7.3452(2.4); 7.3386(2.3); 7.2276(2.8); 7.2178(2.4); 7.2081(3.6); 7.1819(2.0); 7.1787(2.0); 7.1607(4.1); 7.1434(6.7); 7.1244(2.7); 7.0096(0.5); 6.9931(0.7); 6.9503(3.6); 6.9211(5.0); 6.9062(4.3); 6.8877(2.0); 6.7966(5.4); 6.7764(4.8); 6.6351(1.1); 6.5249(5.2); 6.5230(2.4); 5.2154(1.1); 4.2964(0.9); 4.2773(2.4); 4.2608(2.5); 4.2515(2.8); 4.2266(2.2); 4.1995(0.8); 4.0557(1.2); 4.0379(3.4); 4.0201(3.4); 4.0023(1.1); 3.8713(11.2); 3.3206(387.7); 3.2966(7.4); 3.2905(7.0); 3.2825(7.0); 3.2732(5.1); 3.2568(2.4); 3.2395(1.2); 2.6747(1.8); 2.6703(2.4); 2.6661(1.8); 2.5057(315.1); 2.5013(404.4); 2.4970(301.6); 2.4284(0.4); 2.3278(5.0); 2.2944(14.1); 2.2808(14.3); 2.2321(3.2); 2.2139(1.4); 2.2024(1.5); 2.1933(1.5); 2.1807(1.2); 2.0542(1.7); 2.0257(1.2); 2.0200(1.1); 2.0040(0.6); 1.9883(14.3); 1.8912(14.0); 1.8683(13.8); 1.3979(16.0); 1.2586(0.3); 1.2359(0.8); 1.1927(3.8); 1.1749(7.5); 1.1571(3.7); 1.0448(0.8); 1.0296(0.8); -0.0002(5.2)</p>

[1915]

515	3.00	<p>515: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ= 9.1233(0.6), 9.1025(0.6), 8.5606(1.9), 8.2915(0.5), 8.2868(0.5), 8.2717(0.5), 8.2669(0.5), 8.1363(10.5), 7.7032(0.6), 7.6996(0.6), 7.683(2.0), 7.6797(0.7), 7.6686(0.8), 7.6482(1.2), 7.6420(0.9), 7.4299(0.4), 7.3534(0.6), 7.3361(0.7), 7.1628(0.5), 7.1460(0.3), 7.1422(0.3), 6.9168(0.4), 6.8993(0.6), 6.7987(0.7), 6.7787(0.6), 4.2391(0.5), 4.2391(0.4), 3.8217(0.4), 3.8088(0.5), 3.3512(2.2), 3.3298(2.2), 3.3070(2.3), 3.1311(0.5), 3.1135(0.7), 3.0824(4.2), 2.6708(0.4), 2.5061(48.0), 2.5017(62.2), 2.4973(46.5), 2.3283(0.4), 2.0857(16.0), 2.0411(0.4), 2.0329(0.4), 1.7082(0.4), -0.0002(7.0)</p>
516	3.90	<p>516: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ= 8.8758(2.0), 8.8723(2.0), 8.8550(2.1), 8.7191(6.4), 8.7148(6.2), 8.3524(1.2), 8.3445(1.3), 8.3368(1.4), 8.3289(2.5), 8.3210(1.5), 8.3134(1.4), 8.3055(1.3), 7.7689(2.3), 7.7459(4.2), 7.7227(2.4), 7.7125(0.7), 7.7045(0.7), 7.6975(1.2), 7.6926(1.2), 7.6839(1.1), 7.6712(1.2), 7.6640(0.7), 7.6561(0.6), 7.6484(0.5), 7.4239(1.8), 7.4047(1.9), 7.3115(0.8), 7.2995(1.1), 7.2892(1.4), 7.2665(0.7), 7.1748(1.3), 7.1716(1.4), 7.1539(2.8), 7.1364(1.7), 7.1330(1.7), 6.9314(2.0), 6.9130(3.4), 6.8946(1.6), 6.7840(3.8), 6.7652(3.4), 5.2246(0.7), 5.2093(1.6), 5.1923(1.6), 5.1773(0.6), 4.2981(0.4), 4.2901(0.6), 4.2828(0.5), 4.2711(1.6), 4.2620(1.6), 4.2542(2.4), 4.2456(2.6), 4.2255(1.6), 4.2200(1.2), 4.2049(0.4), 4.1983(0.5), 4.0560(0.4), 4.0382(1.3), 4.0204(1.3), 4.0027(0.5), 3.5003(16.0), 3.4938(15.3), 3.4796(0.6), 3.3204(13.4), 3.2904(24.9), 3.2554(0.4), 2.6753(0.4), 2.6707(0.4), 2.6667(0.4), 2.5061(7.1), 2.5017(92.2), 2.4972(69.1), 2.3327(0.4), 2.3285(0.5), 2.3204(13.4), 2.2784(0.7), 2.1686(0.8), 2.1561(1.0), 2.1492(1.0), 2.1437(1.0), 2.1362(0.8), 2.0592(0.7), 2.0512(0.9), 2.0433(1.2), 2.0354(1.1), 2.0257(0.9), 2.0178(0.8), 2.0087(0.8), 2.0018(0.7), 1.9887(6.0), 1.9775(4.4), 1.1929(1.5), 1.1751(3.0), 1.1573(1.4), 0.0079(0.5), 0.0002(12.2), -0.0082(0.5)</p>
518	2.19	<p>518: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ= 9.0894(1.9), 9.0689(1.9), 8.5253(6.9), 8.4176(1.8), 8.3983(2.0), 7.9524(2.4), 7.7616(2.1), 7.7592(2.1), 7.7438(2.6), 7.7414(2.4), 7.7153(0.8), 7.7027(1.6), 7.6900(0.8), 7.6238(6.7), 7.6194(12.3), 7.6103(4.6), 7.6061(3.5), 7.6009(1.5), 7.5766(1.8), 7.5683(2.0), 7.5555(2.0), 7.5374(1.5), 7.3313(1.8), 7.3134(1.9), 7.1897(0.9), 7.1870(0.8), 7.1692(1.8), 7.1516(1.2), 7.1480(1.1), 6.9265(1.3), 6.9239(1.3), 6.9076(2.2), 6.8894(1.1), 6.8877(1.0), 6.8100(2.5), 6.7896(2.3), 5.2760(0.5), 5.2619(1.1), 5.2426(1.1), 5.2280(0.5), 4.6943(1.5), 4.6787(2.2), 4.6755(2.2), 4.6691(1.7), 4.6600(1.9), 4.6536(2.3), 4.6505(2.1), 4.6349(1.6), 4.2989(1.9), 4.2902(3.4), 2.843(4.8), 4.2763(5.3), 4.2612(3.2), 3.8016(1.6), 3.7850(2.6), 3.7698(1.8), 3.3394(0.5), 3.3204(30.7), 3.3072(1.3), 3.2882(0.7), 3.2737(0.4), 2.8904(16.0), 2.7318(13.8), 2.6747(0.4), 2.6701(0.5), 2.6659(0.4), 2.5058(64.7), 2.5014(82.8), 2.4969(60.3), 2.4927(29.6), 2.3281(0.5), 2.1972(0.4), 2.1851(0.4), 2.1757(0.6), 2.1616(0.9), 2.1460(0.7), 2.1320(0.3), 2.0740(2.6), 2.0620(0.8), 2.0505(0.8), 2.0356(0.6), 2.0263(0.6), 2.0164(0.5), 0.0079(1.5), -0.0002(38.6), -0.0085(1.5)</p>
522	2.88	<p>522: ¹H-NMR(601.6 MHz, d₂-DMSO): δ= 9.0428(0.8), 9.0296(0.8), 8.1533(0.8), 8.1394(0.9), 8.1372(0.9), 7.7631(0.8), 7.7608(0.8), 7.7512(1.0), 7.7490(0.9), 7.6672(3.5), 7.6640(3.9), 7.6101(0.9), 7.6069(1.5), 7.5892(0.8), 7.5772(0.8), 7.5752(0.8), 7.5632(0.7), 7.3301(0.6), 7.3172(0.7), 7.1857(0.4), 7.1831(0.4), 7.1716(0.7), 7.1600(0.4), 7.1574(0.4), 6.9380(0.5), 6.9360(0.5), 6.9257(0.8), 6.9149(0.4), 6.9132(0.4), 6.8047(0.9), 6.7924(0.9), 5.7502(1.4), 5.2771(0.4), 5.2642(0.4), 2.903(0.4), 4.2268(0.3), 4.2106(0.5), 3.3053(4.6), 3.3036(16.0), 2.5150(7.7), 2.5060(4.4), 2.5030(9.2), 2.5000(12.7), 2.4970(9.2), 2.4940(4.3), 1.3973(0.8), -0.0002(9.1)</p>
523	2.11	<p>523: ¹H-NMR(601.6 MHz, d₂-DMSO): δ= 9.0676(0.4), 9.0547(0.6), 9.0421(0.3), 8.1664(0.9), 8.1630(0.9), 8.1534(1.1), 8.1499(1.0), 7.6767(1.1), 7.6741(1.1), 7.6632(1.3), 7.6607(1.2), 7.5844(0.6), 7.5726(1.4), 7.5693(2.3), 7.5550(1.3), 7.5467(0.4), 7.4260(0.6), 7.4174(0.4), 7.3207(0.5), 7.3128(0.9), 7.3014(1.2), 7.1740(0.4), 7.1635(0.8), 7.1501(0.4), 6.9255(0.4), 6.9132(0.5), 6.7968(1.0), 6.7823(0.9), 5.3055(0.4), 5.2630(0.4), 5.2568(0.4), 4.2883(0.4), 4.2826(0.4), 4.2086(0.4), 4.1667(0.4), 3.3028(42.7), 3.0387(16.0), 3.0127(0.7), 2.6147(0.4), 2.6116(0.5), 2.6084(0.4), 2.6054(0.5), 2.5208(0.9), 2.5178(1.1), 2.5147(1.2), 2.5059(28.6), 2.5029(63.1), 2.4999(88.1), 2.4968(63.1), 2.4938(29.0), 2.4136(4.2), 2.3889(0.4), 2.3840(0.5), 2.3811(0.4), 2.2183(0.4), 2.2113(0.4), 1.3983(11.6), 0.0052(1.4), -0.0002(61.6), -0.0058(2.3)</p>

[1916]

524	2.34	<p>524: ¹H-NMR(601.6 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0713(0.8), 9.0578(0.8), 8.1990(0.9), 8.1846(0.9), 7.7017(0.8), 7.6914(1.0), 7.6896(1.0), 7.6095(0.9), 7.5972(1.0), 7.5837(0.8), 7.5631(0.4), 7.3217(0.8), 7.3096(0.8), 7.1789(0.8), 7.1680(1.0), 7.1566(0.6), 6.9311(0.6), 6.9192(1.0), 6.9080(0.6), 6.8015(1.0), 6.7876(0.9), 5.2704(0.6), 5.2579(0.5), 4.3124(0.4), 4.3049(0.4), 4.2890(0.4), 4.2320(0.5), 4.2075(0.5), 4.1930(0.3), 4.1891(0.4), 3.3025(59.1), 3.2911(0.4), 3.0396(16.0), 3.0127(0.9), 2.6120(0.9), 2.6084(0.7), 2.6057(0.8), 2.5210(1.5), 2.5180(1.8), 2.5145(1.8), 2.5058(51.6), 2.5030(107.0), 2.5000(145.0), 2.4970(104.8), 2.4942(49.6), 2.4679(7.8), 2.3842(1.0), 2.2364(0.4), 2.2282(0.3), 2.2188(0.4), 2.0703(0.4), 1.3984(0.7), 1.2362(0.8), 0.0966(0.4), 0.0052(2.0), -0.0002(82.2), -0.0057(3.6), -0.1001(0.5)</p>
525	2.62	<p>525: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1140(1.1), 9.1057(1.1), 9.0945(1.2), 9.0855(1.0), 8.5540(6.4), 8.3143(0.7), 8.2423(1.9), 8.2373(1.8), 8.2255(2.0), 8.2176(2.0), 7.7020(2.3), 7.6983(2.3), 7.6822(3.5), 7.6783(2.8), 7.6659(3.1), 7.6457(5.0), 7.6395(3.2), 7.6264(1.0), 7.4582(0.8), 7.4470(0.9), 7.4388(1.7), 7.4279(1.6), 7.4191(1.1), 7.4078(0.9), 7.3495(2.8), 7.3293(3.4), 7.3094(0.8), 7.1767(1.0), 7.1592(2.0), 7.1411(1.3), 6.9254(1.4), 6.9072(2.4), 6.8882(1.1), 6.7955(2.8), 6.7753(2.5), 5.2371(1.1), 5.2227(1.1), 4.2896(0.5), 4.2708(1.3), 4.2555(2.3), 4.2473(2.1), 4.2358(1.2), 4.2282(1.4), 4.2078(0.4), 4.2005(0.3), 3.5676(0.3), 3.3679(1.4), 3.3498(4.3), 3.3208(300.6), 3.0155(14.3), 2.6749(1.8), 2.6704(2.3), 2.6663(1.7), 2.5234(7.5), 2.5058(309.0), 2.5014(394.8), 2.4970(286.9), 2.3325(1.8), 2.3280(2.3), 2.3240(1.7), 2.2142(0.5), 2.2047(0.5), 2.1922(0.8), 2.1823(0.8), 2.1699(0.8), 2.1586(0.6), 2.1484(0.4), 2.0360(0.8), 2.0218(0.7), 2.0092(0.6), 2.0012(0.6), 1.9885(0.8), 1.3979(16.0), 1.2461(3.0), 1.2288(6.1), 1.2111(3.0), 1.1924(0.3), 1.1750(0.4), -0.0002(1.8)</p>
526	3.29	<p>526: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1145(1.7), 9.0942(1.7), 8.5403(7.4), 8.1746(1.7), 8.1548(1.8), 7.6988(2.3), 7.6951(2.4), 7.6788(2.9), 7.6748(3.6), 7.6559(2.9), 7.6357(3.6), 7.6280(3.1), 7.6136(1.0), 7.4537(0.9), 7.4429(0.9), 7.4343(1.8), 7.4235(1.7), 7.4147(1.2), 7.4039(1.0), 7.3536(3.2), 7.3346(3.1), 7.3083(0.9), 7.3051(0.8), 7.1757(1.0), 7.1569(2.0), 7.1382(1.2), 6.9241(1.2), 6.9056(2.1), 6.8868(1.0), 6.7922(2.8), 6.7720(2.5), 5.7549(1.2), 5.2457(0.5), 5.2315(1.2), 5.2132(1.2), 5.1980(0.5), 4.2829(0.5), 4.2761(0.4), 4.2640(1.2), 4.2546(1.2), 4.2470(1.8), 4.2373(1.9), 4.2238(1.1), 4.2164(1.3), 4.1962(0.4), 4.1885(0.4), 3.9291(0.3), 3.9131(0.8), 3.8976(1.1), 3.8822(0.8), 3.8664(0.4), 3.5675(0.5), 3.3231(30.0), 2.9033(16.0), 2.5054(39.1), 2.5010(51.0), 2.4966(38.0), 2.2017(0.4), 2.1928(0.5), 2.1801(0.8), 2.1703(0.8), 2.1590(0.8), 2.1480(0.6), 2.1392(0.4), 2.0400(0.6), 2.0328(0.8), 2.0253(0.9), 2.0145(0.7), 2.0089(0.7), 1.9987(0.6), 1.9884(0.8), 1.3068(3.5), 1.2921(5.6), 1.2777(3.4), 1.2512(3.4), 1.2373(5.5), 1.2230(3.7)</p>
527	3.63	<p>527: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1286(1.0), 9.1083(1.1), 8.6686(4.7), 8.4516(3.2), 8.2373(1.1), 8.2341(1.1), 8.2161(1.3), 8.2128(1.2), 7.8200(1.1), 7.8167(1.2), 7.8022(1.5), 7.7889(1.4), 7.7348(2.1), 7.7297(2.4), 7.6837(1.2), 7.6655(1.2), 7.6626(1.3), 7.6443(2.1), 7.6384(1.9), 7.6320(2.0), 7.3779(1.0), 7.3605(1.1), 7.1943(0.5), 7.1905(0.5), 7.1728(1.0), 7.1559(0.7), 7.1521(0.6), 6.9502(0.7), 6.9476(0.8), 6.9293(1.3), 6.9130(0.6), 6.9103(0.6), 6.8094(1.4), 6.8075(1.4), 6.7889(1.4), 5.2566(0.7), 5.2372(0.7), 4.2852(0.6), 4.2699(1.2), 4.2491(0.6), 4.2412(0.7), 4.2359(0.7), 3.3415(2.2), 3.3200(56.0), 3.0101(9.2), 2.6752(0.5), 2.6706(0.7), 2.6662(0.5), 2.5237(2.3), 2.5103(47.2), 2.5060(93.7), 2.5015(122.2), 2.4970(89.4), 2.4829(45.2), 2.3326(0.6), 2.3283(0.7), 2.3238(0.6), 2.2063(0.4), 2.1961(0.4), 2.1845(0.5), 2.1724(0.3), 2.0710(0.4), 2.0632(0.5), 2.0484(0.4), 2.0365(0.3), 1.3978(16.0), 1.2311(2.6), 1.2134(5.1), 1.1956(2.2), -0.0002(0.5)</p>
534	4.51	<p>534: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 10.4184(1.5), 9.1346(1.4), 9.1144(1.4), 8.6595(5.5), 8.1798(1.4), 8.1587(1.5), 7.8117(1.4), 7.7965(1.8), 7.7941(1.7), 7.7032(0.5), 7.6815(1.4), 7.6605(1.7), 7.6458(10.6), 7.3875(1.3), 7.3689(1.4), 7.1966(0.6), 7.1784(1.4), 7.1608(0.9), 6.9817(0.5), 6.9771(0.9), 6.9724(0.5), 6.9544(1.0), 6.9360(1.6), 6.9173(0.8), 6.8121(1.9), 6.8008(2.0), 6.7960(2.0), 5.2728(0.4), 5.2594(0.8), 5.2391(0.9), 5.2247(0.4), 4.2869(0.8), 4.2708(1.1), 4.2589(1.1), 4.2454(0.7), 4.2376(0.9), 3.8966(0.7), 3.8705(1.0), 3.8538(0.7), 3.3288(47.9), 2.9128(10.7), 2.6782(0.6), 2.5136(82.9), 2.5093(107.6), 2.5050(80.2), 2.3403(0.5), 2.3361(0.6), 2.3319(0.5), 2.2178(0.4), 2.2040(0.5), 2.1942(0.6), 2.1821(0.6), 2.1704(0.5), 2.0675(0.5), 2.0600(0.6), 2.0439(0.5), 2.0335(0.4), 2.0261(0.4), 1.4053(16.0), 1.2887(5.0), 1.2725(5.0), 1.2420(5.3), 1.2258(5.0)</p>

[1917]

535	4.46	<p>535: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 8.8722(0.8), 8.8516(0.8), 8.7041(2.9), 8.2580(1.2), 8.2352(1.4), 7.8664(1.4), 7.8435(1.3), 7.6619(3.4), 7.4145(0.7), 7.3959(0.8), 7.1707(0.4), 7.1537(0.7), 7.1329(0.4), 6.9285(0.5), 6.9101(0.9), 6.8908(0.4), 6.7836(1.0), 6.7635(0.9), 5.2026(0.5), 5.1839(0.5), 4.2665(0.4), 4.2583(0.4), 4.2499(0.6), 4.2428(0.6), 4.2156(0.4), 4.2156(0.5), 3.4842(7.0), 3.3198(29.6), 3.2787(6.2), 2.6708(0.3), 2.5055(44.2), 2.5014(56.4), 2.4974(43.0), 2.3286(0.3), 2.0317(0.4), 1.9886(0.5), 1.3980(16.0), -0.0003(15.4)</p>
540	3.72	<p>540: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9.1842(4.4), 9.1640(4.4), 8.6741(16.0), 8.4617(0.4), 8.3556(3.0), 8.3401(3.2), 8.3321(3.3), 8.3164(3.3), 7.6826(3.4), 7.6594(6.4), 7.6362(2.3), 7.4662(4.8), 7.4486(5.5), 7.4269(4.5), 7.3795(4.1), 7.3605(4.4), 7.1914(2.0), 7.1887(2.0), 7.1711(4.2), 7.1530(2.6), 7.1500(2.5), 6.9408(3.0), 6.9222(5.1), 6.9035(2.4), 6.8037(5.7), 6.7840(5.1), 5.2738(1.2), 5.2586(2.6), 5.2405(2.6), 5.2262(1.1), 4.3027(1.0), 4.2958(0.9), 4.2846(2.4), 4.2751(2.3), 4.2681(2.8), 4.2591(3.5), 4.2517(2.7), 4.2384(2.1), 4.2312(2.7), 4.2103(1.0), 4.2029(0.8), 4.0555(0.7), 4.0377(1.9), 4.0199(1.9), 4.0021(0.7), 3.9008(1.0), 3.8822(6.3), 3.8717(14.3), 3.8610(8.7), 3.3197(180.6), 3.2906(5.5), 3.2801(11.1), 3.2687(10.7), 3.2580(4.7), 3.2387(1.4), 2.6745(1.6), 2.6702(2.1), 2.5055(277.9), 2.5013(357.7), 2.4970(267.8), 2.3321(1.6), 2.3279(2.2), 2.2553(0.6), 2.2451(0.9), 2.2347(1.2), 2.2216(1.7), 2.2121(1.8), 2.1999(1.8), 2.1877(1.3), 2.1789(0.8), 2.0746(1.6), 2.0676(1.9), 2.0556(1.4), 2.0399(1.3), 2.0329(1.2), 1.9833(8.1), 1.3978(1.0), 1.2592(0.3), 1.2341(0.8), 1.1926(2.1), 1.1748(4.1), 1.1569(2.1), -0.0002(42.6)</p>
541	1.78	<p>541: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 8.9748(0.6), 8.9542(0.6), 8.4871(0.4), 8.4708(2.2), 8.4638(0.5), 8.4484(0.4), 8.3359(2.1), 7.9088(0.3), 7.8960(0.4), 7.7294(0.7), 7.7258(0.8), 7.7093(0.9), 7.7057(0.9), 7.5431(0.5), 7.5208(0.8), 7.4979(0.5), 7.4693(0.5), 7.4610(0.4), 7.4497(1.0), 7.4300(0.6), 7.3462(0.3), 7.3415(0.5), 7.3365(0.4), 7.3272(1.1), 7.3228(0.7), 7.3076(0.8), 7.3033(1.1), 7.2820(0.7), 7.1749(0.3), 7.1716(0.3), 7.1539(0.7), 7.1363(0.4), 7.1330(0.4), 6.9111(0.5), 6.8923(0.8), 6.8739(0.4), 6.7934(0.9), 6.7732(0.8), 5.2315(0.4), 5.2128(0.4), 4.2613(0.7), 4.2476(1.2), 4.2347(0.7), 3.3288(21.4), 3.0736(2.0), 3.0669(1.4), 3.0611(2.2), 2.5180(17.5), 2.5140(34.2), 2.5095(44.3), 2.5051(32.0), 2.1427(0.3), 2.0180(0.3), 1.968(0.9), 1.4060(16.0), 1.2437(0.4), 1.1831(0.4)</p>
542	1.66	<p>542: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 8.9915(1.7), 8.9705(1.8), 8.5165(1.4), 8.5013(1.5), 8.4929(1.5), 8.4778(1.3), 8.3922(7.2), 7.9585(0.8), 7.9451(1.0), 7.9379(1.0), 7.9251(0.8), 7.6623(0.4), 7.6538(0.5), 7.6394(0.9), 7.6341(0.9), 7.6261(0.9), 7.6139(0.9), 7.5966(0.5), 7.5902(0.4), 7.5685(1.5), 7.5457(2.8), 7.5228(1.5), 7.3069(1.8), 7.2877(2.0), 7.2113(0.8), 7.2049(1.0), 7.1995(1.0), 7.1755(1.5), 7.1717(1.5), 7.1544(2.2), 7.1367(1.4), 7.1332(1.2), 6.9136(1.5), 6.8949(2.6), 6.8763(1.2), 6.7934(3.0), 6.7729(2.8), 5.7556(16.0), 5.2463(0.6), 5.2312(1.4), 5.2118(1.4), 5.1972(0.6), 4.2576(2.0), 4.2458(3.6), 4.2342(2.0), 4.0382(0.6), 4.0204(0.6), 3.3231(35.1), 3.0726(4.9), 3.0657(6.0), 3.0603(5.8), 3.0534(4.9), 2.6753(0.3), 2.6706(0.4), 2.5103(28.6), 2.5062(55.4), 2.5017(70.8), 2.4972(50.6), 2.3286(0.4), 2.1779(0.8), 2.1644(0.8), 2.1576(0.7), 2.1428(1.0), 2.1289(1.0), 2.1160(0.4), 2.0254(0.8), 2.0189(0.8), 2.0043(0.7), 1.9887(3.0), 1.3974(0.6), 1.3525(0.5), 1.2988(0.3), 1.2590(0.5), 1.2344(1.2), 1.1928(0.7), 1.1750(1.4), 1.1572(0.7), 0.0079(1.9), -0.0002(47.9), -0.0085(1.8)</p>
543	4.25	<p>543: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9.1849(4.4), 9.1647(4.3), 8.7031(1.0), 8.6905(16.0), 8.6712(0.7), 8.3740(3.5), 8.3584(3.8), 8.3503(3.9), 8.3348(3.6), 8.3149(0.5), 7.6883(6.3), 7.6607(7.1), 7.6380(3.7), 7.6243(0.4), 7.3846(4.1), 7.3651(4.7), 7.2348(0.5), 7.2223(4.0), 7.1898(5.8), 7.1718(5.0), 7.1540(3.1), 7.1505(2.8), 6.9435(3.5), 6.9267(5.9), 6.9083(2.7), 6.8046(6.4), 6.7845(5.9), 6.7731(0.4), 5.7551(0.4), 5.2587(2.7), 5.2416(2.7), 5.2278(1.2), 4.3052(1.2), 4.2978(1.1), 4.2860(2.8), 4.2761(2.8), 4.2697(3.2), 4.2611(3.9), 4.2528(2.9), 4.2390(2.5), 4.2324(3.0), 4.2105(1.4), 4.2039(0.9), 4.0559(0.6), 4.0377(1.8), 4.0200(1.8), 4.0019(0.6), 3.8664(15.1), 3.3202(106.3), 3.2860(10.0), 3.2751(9.5), 2.6740(1.4), 2.6705(1.8), 2.6660(1.4), 2.5055(243.9), 2.5012(311.2), 2.4968(223.6), 2.3279(1.8), 2.3233(1.3), 2.3276(1.3), 2.2238(1.9), 2.2145(2.0), 2.2028(2.0), 2.1943(1.4), 2.1895(1.5), 2.0685(1.8), 2.0522(1.6), 1.9883(7.3), 1.3976(5.4), 1.3510(0.4), 1.2965(0.4), 1.2588(0.4), 1.2354(1.3), 1.1925(1.9), 1.1747(3.9), 1.1588(1.8), 0.1464(0.7), 0.0222(0.4), 0.0079(6.3), -0.0002(153.6), -0.0085(5.8), -0.1493(0.7)</p>

[1918]

544	2.80	<p>544: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.1606(3.0), 9.1401(3.1), 8.6477(12.1), 8.2912(12.2), 8.2755(2.4), 8.2676(2.5), 8.2521(2.3), 7.6215(2.5), 7.5986(4.5), 7.5757(2.5), 7.3791(2.8), 7.3620(3.0), 7.1920(1.4), 7.1885(1.4), 7.1709(2.9), 7.1534(1.8), 7.1497(1.7), 6.9443(2.1), 6.9421(2.1), 6.9256(3.6), 6.9236(3.5), 6.9073(1.7), 6.9047(1.7), 6.8055(4.1), 6.7851(3.8), 6.6355(2.1), 5.7553(12.7), 5.2771(0.8), 5.2633(1.8), 5.2443(1.8), 5.2300(0.8), 4.3146(0.5), 4.3063(0.7), 4.2990(0.6), 4.2870(1.6), 4.2781(1.6), 4.2711(2.0), 4.2624(2.4), 4.2554(1.9), 4.2420(1.5), 4.2344(1.9), 4.2136(0.7), 4.2060(0.5), 3.8626(9.5), 3.8532(5.6), 3.8342(0.7), 3.8221(0.4), 3.3200(38.5), 3.2903(3.2), 3.2796(6.3), 3.2671(6.0), 3.2350(1.0), 2.6787(0.3), 2.6702(0.8), 2.5231(2.6), 2.5097(54.0), 2.5055(106.3), 2.5010(136.5), 2.4965(96.8), 2.4922(46.2), 2.4203(16.0), 2.3242(1.1), 2.2576(0.5), 2.2436(0.7), 2.2357(0.9), 2.2233(1.1), 2.2137(1.2), 2.2007(1.2), 2.1694(0.9), 2.1607(0.6), 2.0829(7.5), 2.0400(1.0), 2.0318(0.8), 2.0159(0.4), 1.9882(0.8), 1.5432(0.7), 1.3973(1.0), 1.3513(0.4), 1.2587(0.5), 1.2336(0.9), 1.1746(0.4), 0.1459(0.4), 0.0079(3.7), -0.0002(97.6), -0.0085(3.4), -0.1493(0.4)</p>
545	1.90	<p>545: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.0012(2.2), 8.9809(2.3), 8.5133(1.7), 8.4986(1.6), 8.4897(1.6), 8.4749(1.4), 8.4325(7.9), 8.2292(0.6), 8.0071(1.3), 7.9948(1.2), 7.6863(14.1), 7.5760(1.7), 7.5526(3.2), 7.5293(1.7), 7.3076(2.2), 7.2888(2.2), 7.1799(1.0), 7.1765(1.2), 7.1589(2.2), 7.1414(1.4), 7.1380(1.3), 6.9211(1.7), 6.9184(1.6), 6.9022(2.7), 6.8999(2.7), 6.8839(1.3), 6.8811(1.3), 6.8673(3.0), 6.8082(0.3), 6.7983(3.0), 6.7961(3.0), 6.7779(2.8), 6.7756(2.6), 5.7552(16.0), 5.2468(0.7), 5.2319(1.5), 5.2124(1.4), 5.1971(0.6), 4.2623(2.5), 4.2494(1.4), 4.2359(2.4), 4.0381(0.9), 4.0202(1.0), 3.3223(44.4), 3.0701(8.6), 3.0576(8.5), 3.0357(0.8), 2.6709(0.4), 2.6655(0.4), 2.5106(38.2), 2.5063(75.6), 2.5018(97.9), 2.4973(70.3), 2.4929(33.9), 2.3332(0.4), 2.3285(0.6), 2.3240(0.4), 2.1939(0.3), 2.1939(0.3), 2.1646(0.8), 2.1595(0.7), 2.1436(1.1), 2.1303(1.0), 2.1160(0.4), 2.0570(0.5), 2.0446(1.0), 2.0307(1.2), 2.0172(0.7), 1.9887(4.5), 1.9887(4.5), 1.2590(0.4), 1.2335(0.7), 1.1928(1.2), 1.1750(2.3), 1.1573(1.2), -0.0002(3.4)</p>
546	3.68	<p>546: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.1871(4.2), 9.1669(4.3), 8.6805(16.0), 8.3627(2.8), 8.3473(3.0), 8.3393(3.2), 8.3236(2.9), 7.6904(3.2), 7.6672(6.0), 7.6441(3.1), 7.5394(2.8), 7.4347(8.4), 7.4122(8.4), 7.3793(3.9), 7.3591(9.8), 7.1913(2.0), 7.1880(2.1), 7.1765(3.6), 7.1709(4.1), 7.1531(2.5), 7.1496(2.3), 6.9405(2.8), 6.9219(4.7), 6.9054(2.3), 6.9030(2.3), 6.8038(5.3), 6.7850(4.9), 5.7551(10.2), 5.2756(1.1), 5.2613(2.4), 5.2412(2.4), 5.2271(1.1), 4.3122(0.6), 4.3044(1.0), 4.2852(2.2), 4.2768(2.1), 4.2686(2.6), 4.2604(3.2), 4.2535(2.5), 4.2393(2.0), 4.2322(2.6), 4.2123(1.0), 3.8842(7.5), 3.8735(13.0), 3.8634(7.8), 3.3201(103.8), 3.2938(4.9), 3.2835(10.0), 3.2721(9.7), 3.2610(4.3), 3.2399(1.3), 3.2399(1.3), 2.6748(1.0), 2.6701(1.4), 2.6655(1.0), 2.5055(190.0), 2.5011(244.6), 2.4967(177.2), 2.4494(0.6), 2.3276(1.4), 2.3242(1.1), 2.2561(0.6), 2.2356(1.1), 2.2230(1.5), 2.2142(1.6), 2.2015(1.6), 2.1897(1.2), 2.1810(0.7), 2.0889(0.9), 2.0734(1.5), 2.0661(1.7), 2.0509(1.3), 2.0397(1.2), 2.0325(1.2), 1.9882(0.6), 1.2589(0.5), 1.2354(1.3), 0.1459(0.4), 0.0078(3.5), -0.0002(86.5), -0.0082(3.6), -0.1499(0.4)</p>
547	1.81	<p>547: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 8.9803(2.7), 8.9596(2.7), 8.4533(1.8), 8.4383(2.0), 8.4292(2.0), 8.4129(11.0), 7.9213(1.6), 7.9079(1.6), 7.5407(2.0), 7.5240(2.5), 7.5175(4.0), 7.4943(2.0), 7.3844(5.7), 7.3618(5.8), 7.3439(4.5), 7.3054(2.7), 7.2871(2.9), 7.1762(1.3), 7.1748(1.4), 7.1612(3.1), 7.1396(1.7), 7.1361(1.6), 6.9171(2.0), 6.8987(3.4), 6.8820(1.6), 6.8798(1.6), 6.7965(3.8), 6.7760(3.5), 6.7553(11.4), 5.2518(0.8), 5.2370(1.7), 5.2169(1.7), 5.2030(0.8), 4.2627(2.9), 4.2496(5.0), 4.2364(2.9), 4.0557(1.2), 4.0379(3.6), 4.0201(3.7), 4.0023(1.2), 3.3210(2.0), 3.0647(10.6), 3.0522(10.4), 2.6745(0.4), 2.6702(0.5), 2.6655(0.4), 2.5056(68.9), 2.5012(88.8), 2.4968(63.5), 2.3277(0.6), 2.1932(0.4), 2.1801(0.9), 2.1656(0.9), 2.1595(0.8), 2.1448(1.4), 2.1311(1.3), 2.1176(0.5), 2.0530(0.5), 2.0414(1.2), 2.0266(1.4), 2.0130(0.8), 2.0054(1.0), 1.9884(16.0), 1.3975(2.5), 1.1926(4.0), 1.1748(8.0), 1.1570(3.9), 0.0078(1.4), -0.0002(35.4), -0.0085(1.2)</p>

[1919]

548	3.33	<p>548: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1827(2.9); 9.1746(2.9); 9.1624(3.2); 9.1541(2.8); 8.6506(10.0); 8.6441(9.3); 8.3965(3.4); 8.3810(3.7); 8.3731(3.8); 8.3574(3.6); 8.3157(10.3); 7.7100(3.6); 7.6872(6.5); 7.6643(3.3); 7.5745(1.2); 7.5534(2.7); 7.5321(2.9); 7.5111(1.3); 7.3747(4.9); 7.3560(6.6); 7.3355(3.1); 7.3257(2.3); 7.3156(1.9); 7.3046(1.1); 7.2896(1.7); 7.2743(2.2); 7.2492(2.1); 7.2300(1.0); 7.1862(2.3); 7.1655(4.9); 7.1478(3.0); 6.9332(3.2); 6.9148(5.4); 6.8959(2.6); 6.8004(6.6); 6.7799(6.0); 5.7555(3.2); 5.2752(0.8); 5.2508(2.6); 5.2420(2.6); 4.3002(1.2); 4.2936(1.0); 4.2819(2.8); 4.2723(2.7); 4.2654(3.1); 4.2555(3.7); 4.2280(2.8); 4.2046(1.0); 3.8768(16.0); 3.3266(24.3); 3.2960(10.6); 3.2914(10.6); 3.2511(1.4); 2.6702(1.3); 2.5058(182.0); 2.5015(222.3); 2.4972(161.2); 2.3286(1.3); 2.2435(1.1); 2.2317(1.3); 2.2215(1.8); 2.2084(1.8); 2.1980(1.8); 2.0647(2.1); 2.0577(1.9); 2.0466(1.7); 2.0297(1.5); 1.9886(0.8); 1.3976(0.6); 1.2331(0.4); 1.1748(0.4); 0.1462(0.3); -0.0002(64.9)</p>
549	3.59	<p>549: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1861(3.0); 9.1775(3.0); 9.1663(3.2); 9.1573(2.8); 8.6558(10.4); 8.6485(9.7); 8.4036(3.6); 8.3879(4.0); 8.3801(4.1); 8.3645(3.7); 7.7158(3.7); 7.6930(6.8); 7.6701(3.6); 7.4984(0.6); 7.4765(1.7); 7.4585(2.0); 7.4508(1.9); 7.4253(0.8); 7.3779(5.5); 7.3587(6.9); 7.3388(2.2); 7.3334(2.2); 7.3157(1.4); 7.2930(0.5); 7.1648(2.4); 7.1676(5.0); 7.1497(3.0); 6.9361(3.1); 6.9174(5.4); 6.8989(2.5); 6.8016(6.9); 6.7814(6.3); 5.7559(2.5); 5.2740(0.8); 5.2602(2.1); 5.2512(2.6); 5.2405(2.6); 5.2313(2.0); 4.3086(0.8); 4.3013(1.2); 4.2948(1.0); 4.2818(2.8); 4.2730(2.7); 4.2658(3.2); 4.2565(3.6); 4.2288(2.8); 4.2034(1.0); 3.8760(16.0); 3.3215(55.4); 3.2905(11.0); 3.2507(1.4); 2.6706(0.9); 2.5058(119.4); 2.5015(151.2); 2.4972(110.3); 2.3287(0.9); 2.3246(0.7); 2.2345(1.2); 2.2183(1.8); 2.2090(1.8); 2.2017(1.8); 2.0818(1.2); 2.0746(1.7); 2.0663(2.0); 2.0592(1.9); 2.0404(1.5); 2.0321(1.5); 1.2343(0.6); -0.0002(41.6)</p>
550	3.94	<p>550: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.2014(2.6); 9.1811(2.6); 8.7076(8.9); 8.4095(1.7); 8.3941(1.9); 8.3860(1.9); 8.3705(1.8); 7.7354(16.0); 7.7206(2.0); 7.6972(3.6); 7.6740(1.8); 7.3644(2.5); 7.3654(2.7); 7.1898(1.2); 7.1721(2.6); 7.1543(1.6); 6.9445(1.7); 6.9254(3.0); 6.9075(1.5); 6.8061(3.4); 6.7859(3.1); 5.7556(5.5); 5.2691(0.7); 5.2558(1.6); 5.2362(1.6); 5.2219(0.7); 4.3031(0.6); 4.2966(0.6); 4.2847(1.4); 4.2684(1.7); 4.2592(2.1); 4.2512(1.6); 4.2303(1.6); 4.2087(0.6); 4.2024(0.5); 3.8768(8.7); 3.3202(36.4); 3.2752(6.4); 3.2441(0.8); 2.6703(0.7); 2.5053(96.3); 2.5013(118.5); 2.4974(89.0); 2.3275(0.6); 2.2343(0.7); 2.2204(1.0); 2.2115(1.1); 2.1996(1.1); 2.1886(0.8); 2.0703(1.2); 2.0576(0.9); 2.0431(0.8); 2.0347(0.7); 1.3974(0.4); 1.2345(0.4); -0.0002(27.3)</p>
553	4.18	<p>553: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1942(4.5); 9.1740(4.6); 8.6557(16.0); 8.3213(6.5); 8.2983(7.3); 8.2397(0.6); 7.8522(0.4); 7.8288(0.5); 7.8164(7.8); 7.7936(7.3); 7.6328(14.6); 7.5168(0.4); 7.3705(4.3); 7.3519(4.8); 7.1870(2.2); 7.1668(4.5); 7.1485(2.8); 6.9330(3.1); 6.9143(5.5); 6.8959(2.6); 6.8001(6.2); 6.7796(5.6); 5.2596(1.3); 5.2452(2.9); 5.2264(2.8); 5.2114(1.2); 4.2957(1.1); 4.2877(1.0); 4.2761(2.5); 4.2673(2.4); 4.2605(2.8); 4.2489(3.1); 4.2407(2.7); 4.2265(2.3); 4.2194(2.9); 4.1983(1.1); 4.0552(0.9); 4.0376(2.5); 4.0198(2.5); 4.0023(0.8); 3.8740(14.9); 3.3214(154.1); 3.2935(5.8); 3.2622(11.0); 3.2705(10.5); 3.2585(4.9); 3.2385(1.7); 3.2278(1.0); 2.6701(1.4); 2.5049(207.4); 2.5012(254.2); 2.3283(1.5); 2.2354(1.0); 2.2257(1.3); 2.2134(1.8); 2.2038(1.8); 2.1918(1.9); 2.1798(1.4); 2.0681(1.3); 2.0602(1.8); 2.0537(2.0); 2.0381(1.6); 2.0288(1.4); 2.0194(1.3); 1.9883(10.2); 1.3975(3.1); 1.1926(2.6); 1.1748(5.2); 1.1569(2.6); -0.0002(37.7)</p>

[1920]

556	3.76	<p>556: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1775(4.0);9.1574(4.0);8.6286(16.0);8.2793(6.4);8.2565(7.2);7.7842(7.7);7.7614(7.2);7.3674(3.9);7.3493(4.2);7.3373(1.2);7.3314(1.8);7.3260(1.1);7.3134(2.1);7.3077(3.5);7.3022(2.0);7.2894(1.2);7.2839(1.8);7.2783(1.0);7.1648(1.9);7.1813(1.9);7.1639(4.0);7.1462(2.5);7.1426(2.4);7.0495(3.6);7.0319(3.7);6.9289(2.8);6.9112(4.9);6.8933(2.3);6.7977(5.5);6.7777(5.0);5.2649(1.1);5.2506(2.5);5.2315(2.4);5.2174(1.1);4.3044(0.7);4.2959(0.9);4.2888(0.8);4.2769(2.2);4.2680(2.1);4.2605(2.5);4.2509(3.0);4.2426(2.4);4.2290(2.0);4.2219(2.6);4.2011(0.9);4.1935(0.7);4.0555(0.5);4.0377(1.3);4.0200(1.3);4.0024(0.4);3.9436(0.5);3.9000(1.0);3.8818(7.6);3.8708(1.3);3.8600(7.7);3.8413(0.9);3.3245(50.8);3.2916(4.7);3.2805(9.6);3.2687(9.2);3.2568(4.1);3.2378(1.4);3.2256(0.8);2.6700(0.7);2.5055(102.0);2.5013(130.9);2.4971(94.4);2.3278(0.7);2.3235(0.6);2.2484(0.5);2.2360(0.8);2.2276(1.1);2.2147(1.6);2.2056(1.6);2.1931(1.6);2.1805(1.1);2.1718(0.7);2.0755(0.8);2.0686(1.1);2.0602(1.5);2.0533(1.7);2.0417(1.3);2.0374(1.3);2.0257(1.2);2.0184(1.1);2.0112(0.7);2.0030(0.5);1.9883(5.2);1.3974(2.9);1.1927(1.3);1.1749(2.7);1.1570(1.3);0.0076(2.5);-0.0002(60.6);-0.0083(2.4)</p>
557	4.23	<p>557: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1770(4.0);9.1568(4.0);8.6318(16.0);8.2815(6.3);8.2566(7.2);7.7872(7.7);7.7643(7.2);7.5227(2.3);7.5178(3.8);7.5126(2.4);7.5006(2.4);7.4956(3.8);7.4903(2.2);7.3684(3.9);7.3501(4.2);7.2192(3.2);7.1851(3.5);7.1820(3.5);7.1648(4.7);7.1470(2.6);6.9298(2.8);6.9121(4.8);6.8925(2.2);6.7984(5.5);6.7782(5.0);5.2636(1.1);5.2493(2.5);5.2297(2.4);5.2151(1.1);4.3038(0.7);4.2952(0.9);4.2888(0.8);4.2770(2.2);4.2672(2.1);4.2608(2.5);4.2508(3.0);4.2422(2.3);4.2287(1.9);4.2214(2.5);4.2007(0.9);4.1935(0.7);4.0556(0.6);4.0380(1.7);4.0202(1.7);4.0025(0.6);3.8712(12.8);3.8615(7.6);3.8422(1.0);3.3270(205.6);3.2914(4.9);3.2806(9.1);3.2689(8.6);3.2572(4.0);3.2371(1.4);3.2266(0.9);2.6709(1.1);2.5062(163.1);2.5020(209.0);2.4978(151.9);2.3325(0.9);2.3283(1.2);2.2365(0.8);2.2271(1.2);2.2144(1.6);2.2047(1.6);2.1929(1.6);2.1816(1.1);2.0760(0.8);2.0586(1.5);2.0530(1.7);2.0413(1.3);2.0256(1.2);2.0181(1.1);1.9885(7.1);1.3976(3.1);1.1928(1.8);1.1750(3.6);1.1571(1.8);-0.0001(4.8)</p>
558	4.13	<p>558: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1706(2.1);9.1527(2.1);8.6027(16.0);8.3154(0.4);8.2902(6.2);8.2673(7.0);7.8025(8.8);7.7881(4.9);7.7796(7.8);7.7481(1.9);7.7286(3.3);7.7088(1.6);7.6194(3.7);7.3615(3.8);7.3434(4.1);7.1811(1.8);7.1774(1.8);7.1595(3.9);7.1424(2.4);6.9232(2.7);6.9052(4.6);6.8870(2.1);6.7953(5.5);6.7750(4.9);5.7551(2.1);5.2581(1.1);5.2446(2.4);5.2255(2.4);5.2107(1.0);4.2995(0.7);4.2915(0.9);4.2856(0.9);4.2727(2.2);4.2642(2.1);4.2566(2.4);4.2466(2.5);4.2376(2.0);4.2163(2.1);4.1951(0.8);4.0377(0.4);4.0201(0.4);3.8775(1.0);3.3239(26.3.3);3.2894(6.2);2.6705(1.7);2.5236(4.5);2.5060(239.6);2.5017(306.1);2.4975(218.6);2.3284(1.8);2.2452(0.5);2.2233(1.1);2.2104(1.6);2.2010(1.6);2.1894(1.6);2.1774(1.2);2.0573(1.4);2.0498(1.6);2.0372(1.3);2.0225(1.1);1.9886(1.7);1.3974(1.0);1.1924(0.4);-1.1748(0.9);-1.1577(0.4);0.1461(0.6);0.0077(5.0);-0.0002(134.8);-0.0084(5.2);-0.1496(0.6)</p>
564		<p>564: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1810(3.4);9.1696(3.5);9.1614(3.8);9.1496(3.2);8.6214(12.6);8.6138(11.8);8.3155(9.4);8.2926(10.6);7.8206(10.0);7.7978(9.3);7.7086(2.5);7.6910(5.4);7.6854(4.8);7.6715(3.4);7.6673(2.9);7.3843(1.6);7.3653(9.7);7.3517(10.5);7.3473(13.2);7.3334(5.8);7.3249(2.6);7.3201(3.2);7.3053(2.8);7.2898(1.2);7.1810(2.8);7.1612(6.0);7.1427(3.7);6.9258(3.4);6.9073(5.7);6.8889(2.7);6.7951(8.5);6.7751(7.6);5.2617(1.1);5.2413(3.1);5.2284(3.2);4.3001(1.0);4.2943(1.4);4.2748(3.1);4.2656(3.1);4.2565(3.6);4.2497(3.8);4.2408(3.2);4.2317(2.4);4.2203(3.4);4.2129(2.7);4.1923(1.3);3.8727(16.0);3.3218(136.5);3.3010(10.8);3.2915(10.8);3.2796(9.0);3.2589(3.1);3.2398(1.7);2.6700(2.2);2.5051(310.4);2.5010(398.1);2.4968(287.4);2.4242(0.4);2.3275(2.3);2.2091(2.0);2.2014(2.2);2.1944(2.1);2.1809(1.7);2.0525(2.2);2.0436(2.2);2.0258(1.9);2.0176(1.6);1.2348(0.8);-0.0003(13.2)</p>

[1921]

565	4.03	<p>565: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9.1794(1.1), 9.1588(1.1), 8.7822(0.5), 8.6253(3.8), 8.6202(3.9), 8.3083(2.9), 8.2853(2.9), 8.1003(3.2), 7.7871(3.1), 7.5936(0.8), 7.5884(0.9), 7.5823(0.9), 7.5752(0.9), 7.5711(1.0), 7.5643(1.2), 7.5604(1.0), 7.5534(0.9), 7.4579(0.8), 7.4511(0.8), 7.4423(0.8), 7.4357(0.8), 7.4271(1.0), 7.4220(1.0), 7.4150(1.0), 7.4053(2.2), 7.4002(1.1), 7.3875(1.7), 7.3829(0.9), 7.3655(2.0), 7.3489(1.5), 7.1836(0.8), 7.1634(1.6), 7.1453(1.0), 6.9293(1.1), 6.9265(1.2), 6.9101(1.8), 6.8921(0.9), 6.8889(0.9), 6.7963(2.2), 6.7760(1.8), 5.2433(0.8), 5.2305(0.7), 4.2945(0.4), 4.2750(0.9), 4.2602(0.9), 4.2468(0.9), 4.2383(0.9), 4.2248(0.8), 4.2184(1.0), 4.1975(0.4), 3.8814(3.0), 3.8723(5.0), 3.8602(3.1), 3.8410(0.5), 3.3215(1.39), 3.2898(3.6), 3.2785(3.4), 2.7852(1.3), 2.6702(1.7), 2.6655(1.2), 2.5235(4.2), 2.5187(6.8), 2.5100(1.10), 3.2.5057(2.27), 2.5012(2.99), 2.4966(2.10), 2.4922(9.7), 2.3323(1.2), 2.3278(1.7), 2.2084(0.6), 2.1892(0.6), 2.0604(0.5), 2.0532(0.7), 2.0449(0.6), 2.0371(0.5), 2.0276(0.4), 2.0192(0.5), 1.5301(3.1), 1.4948(3.2), 1.4885(1.2), 1.4529(0.9), 1.3976(1.6), 1.2344(0.4), -0.0002(8.6)</p>
566	1.71	<p>566: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 8.9879(3.8), 8.9680(3.8), 8.4481(5.6), 8.4300(12.0), 8.4220(8.5), 7.9521(0.3), 7.9237(2.0), 7.8814(15.0), 7.8752(16.0), 7.8612(2.1), 7.6249(5.2), 7.6083(8.1), 7.5614(6.4), 7.5405(6.8), 7.5226(4.2), 7.4339(4.4), 7.4279(4.4), 7.4173(4.7), 7.4114(4.0), 7.3027(4.2), 7.2830(4.5), 7.1708(2.8), 7.1673(2.8), 7.1501(5.7), 7.1322(3.5), 7.1285(3.3), 6.9055(4.0), 6.9032(4.2), 6.8847(7.0), 6.8684(3.2), 6.8659(3.2), 6.7898(7.8), 6.7694(7.1), 5.7569(11.9), 5.2623(1.4), 5.2467(3.2), 5.2284(3.1), 5.2128(1.3), 4.9059(4.0), 4.8931(8.8), 4.8804(4.0), 4.2657(0.9), 4.2659(3.8), 4.2579(5.8), 4.2484(6.9), 4.2336(4.0), 4.2151(1.0), 4.0556(0.4), 4.0378(1.2), 4.0198(1.1), 4.0021(0.1), 3.6850(2.4), 3.6707(7.8), 3.6573(10.0), 3.6444(4.9), 3.5952(5.7), 3.5840(6.8), 3.5721(4.3), 3.3213(90.6), 2.6744(1.3), 2.6702(1.8), 2.6657(1.3), 2.5234(4.8), 2.5098(12.4), 2.5055(249.9), 2.5011(329.4), 2.4966(234.1), 2.4923(11.1), 2.3323(1.3), 2.3278(1.9), 2.3234(1.4), 2.1873(0.7), 2.1740(1.2), 2.1642(1.4), 2.1534(1.8), 2.1403(2.5), 2.1243(2.1), 2.1117(1.0), 2.0664(1.0), 2.0521(2.3), 2.0411(2.4), 2.0253(1.7), 2.0167(1.6), 2.0074(1.3), 1.9896(5.2), 1.2582(0.4), 1.2344(1.0), 1.1922(1.2), 1.1743(2.6), 1.1567(1.2), 1.1459(0.7), 0.0079(5.6), -0.0002(166.0), -0.0084(5.9), -0.1494(0.7)</p>
567	1.42	<p>567: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9.0073(3.6), 8.9868(3.7), 8.4799(13.7), 8.4638(3.9), 8.4434(4.0), 7.9315(1.6), 7.9195(3.1), 7.9073(1.7), 7.7132(4.1), 7.6963(5.2), 7.5965(0.8), 7.5887(1.0), 7.5790(4.5), 7.5685(2.0), 7.5606(5.4), 7.5581(5.4), 7.5477(1.9), 7.5399(3.8), 7.5256(0.8), 7.3116(3.6), 7.2930(4.0), 7.1762(3.3), 7.1726(3.6), 7.1555(5.2), 7.1378(2.3), 7.1341(2.2), 6.9102(2.7), 6.8919(4.6), 6.8733(2.2), 6.7949(5.1), 6.7747(4.7), 5.7571(3.2), 5.2731(1.0), 5.2573(2.3), 5.2384(2.3), 5.2240(1.0), 4.9044(2.7), 4.8916(6.1), 4.8787(2.9), 4.3020(0.4), 4.2928(0.6), 4.2733(2.5), 4.2651(3.9), 4.2551(4.4), 4.2492(4.0), 4.2396(2.5), 4.2218(0.6), 3.6817(1.5), 3.6675(5.2), 3.6542(6.9), 3.6416(3.4), 3.6086(3.1), 3.5963(6.2), 3.5830(4.7), 3.5689(1.4), 3.3218(25.0), 2.6745(0.7), 2.6703(1.0), 2.6662(0.8), 2.5233(2.6), 2.5055(133.6), 2.5012(174.2), 2.4970(126.3), 2.3276(1.0), 2.1948(0.4), 2.1840(0.8), 2.1720(0.9), 2.1606(1.2), 2.1486(1.7), 2.1341(1.4), 2.1194(0.7), 2.0856(16.0), 2.0641(1.7), 2.0532(1.6), 2.0376(1.2), 2.0288(1.1), 2.0193(0.9), 2.0128(0.7), 2.0046(0.4), 1.9887(0.9), 1.2351(0.7), 1.1745(0.4), -0.0001(3.6)</p>
568	1.53	<p>568: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9.0342(1.9), 9.0140(2.0), 8.5727(6.2), 8.4892(2.2), 8.4672(2.2), 8.4420(0.6), 8.2975(0.4), 8.2615(1.1), 8.0721(0.9), 8.0606(1.6), 8.0483(1.0), 7.9562(0.5), 7.8662(2.1), 7.8497(2.5), 7.8153(16.0), 7.7977(0.6), 7.5936(1.8), 7.5727(1.8), 7.5543(1.8), 7.3024(1.8), 7.3024(2.2), 7.1821(0.9), 7.1645(2.0), 7.1470(1.4), 7.1436(1.4), 6.9222(1.3), 6.9040(2.4), 6.8850(1.3), 6.8045(2.6), 6.7848(2.5), 5.7572(7.2), 5.7396(0.3), 5.2804(0.6), 5.2654(1.3), 5.2464(1.4), 5.2318(0.7), 4.9134(1.6), 4.9007(3.2), 4.8881(1.6), 4.3032(0.4), 4.2833(1.4), 4.2743(2.1), 4.2633(2.5), 4.2580(2.6), 4.2482(1.7), 4.2305(0.6), 4.0379(0.8), 4.0201(0.9), 4.0023(0.3), 3.6661(2.9), 3.6533(3.7), 3.6407(2.2), 3.6145(2.2), 3.6024(3.4), 3.5894(2.6), 3.3241(7.3), 3.3074(0.5), 2.5060(41.9), 2.5018(53.4), 2.4975(40.1), 2.1877(0.4), 2.1793(0.5), 2.1681(0.8), 2.1557(1.0), 2.1410(0.9), 2.1258(0.6), 2.0946(0.5), 2.0799(0.9), 2.0699(1.0), 2.0542(0.8), 2.0447(0.7), 2.0357(0.6), 2.0293(0.5), 1.9890(3.5), 1.9888(0.4), 1.2585(0.5), 1.2312(0.7), 1.1925(1.0), 1.1747(1.8), 1.1569(1.0), -0.0002(1.2)</p>

[1922]

576	3.90	<p>576: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 20.0029(0.9); 18.8916(0.9); 16.94(6.2); 8.6464(14.7); 8.6381(15.0); 8.3318(10.9); 8.3089(11.9); 7.8301(11.0); 7.8072(10.0); 7.6892(1.6); 7.6682(2.6); 7.6486(2.6); 7.4026(1.1); 7.3714(3.5); 7.3527(4.2); 7.1646(7.5); 7.1472(4.8); 6.9296(4.4); 6.9103(7.1); 6.8923(3.8); 6.7973(8.0); 6.7765(7.6); 5.2293(3.2); 4.2951(1.7); 4.2767(3.3); 4.2608(3.4); 2.507(3.5); 4.2420(3.3); 4.2203(3.7); 4.1924(1.5); 3.9161(1.0); 3.9087(1.1); 3.8728(16.0); 3.7425(1.0); 3.3196(381.7); 3.2976(12.2); 3.2873(11.7); 3.2380(1.9); 2.6744(7.0); 2.6702(9.7); 2.6655(7.0); 2.6612(3.6); 2.5233(22.0); 2.5089(648.2); 2.5055(1360.8); 2.5010(1822.1); 2.4965(1299.0); 2.4920(613.8); 2.4282(2.0); 2.3323(7.9); 2.3277(10.7); 2.3234(7.8); 2.2851(1.0); 2.2044(2.7); 2.0556(2.4); 2.0356(2.2); 1.2408(1.1); -0.0002(68.2)</p>
577	1.66	<p>577: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 8.9783(4.8); 8.9578(4.8); 8.5458(3.4); 8.5302(3.7); 8.5222(3.6); 8.5068(3.4); 8.4827(1.4); 8.4655(0.4); 8.4574(0.4); 8.4398(0.4); 8.4133(2.7); 8.4054(16.0); 8.0443(0.8); 8.0308(0.5); 8.0114(0.4); 7.9945(1.9); 7.9831(3.6); 7.9722(1.9); 7.7219(5.6); 7.7183(5.8); 7.7019(6.8); 7.6982(6.6); 7.5396(0.4); 7.5281(3.8); 7.5054(6.4); 7.4834(4.5); 7.4711(5.3); 7.4516(9.8); 7.4431(1.6); 7.4319(5.6); 7.4231(0.9); 7.3921(0.3); 7.3727(0.6); 7.3473(6.3); 7.3436(6.5); 7.3281(5.6); 7.3245(4.7); 7.3118(0.8); 7.2873(4.7); 7.2693(5.2); 7.1660(2.4); 7.1634(2.4); 7.1455(5.1); 7.1282(3.2); 7.1246(3.0); 6.8960(3.8); 6.8769(6.2); 6.8606(2.8); 6.7653(6.9); 6.7650(6.3); 6.6074(0.5); 6.5916(0.4); 5.7570(8.6); 5.2502(1.6); 5.2353(3.1); 5.2157(3.0); 5.2010(1.4); 4.9112(3.8); 4.8980(8.6); 4.8853(3.9); 4.2747(0.8); 4.2402(7.3); 4.2276(4.6); 4.2100(0.7); 4.1986(0.4); 4.0553(0.7); 4.0376(2.0); 4.0197(1.9); 4.0019(0.8); 3.6838(2.3); 3.6695(7.4); 3.6437(4.5); 3.5967(4.6); 3.5846(8.3); 3.5711(6.6); 3.5569(2.0); 3.5289(0.4); 3.4240(0.3); 3.3211(225.0); 2.6744(2.4); 2.6700(3.2); 2.6655(2.3); 2.6025(0.4); 2.5795(0.3); 2.5234(7.9); 2.5096(213.1); 2.5055(434.5); 2.5010(573.6); 2.4966(408.4); 2.4923(193.6); 2.4434(0.9); 2.4385(0.9); 2.3322(2.3); 2.3277(3.3); 2.3232(2.3); 2.1689(1.4); 2.1475(1.8); 2.1338(2.6); 2.1207(2.2); 2.1056(1.0); 2.0549(1.1); 2.0409(2.3); 2.0263(2.3); 2.0117(1.7); 2.0043(1.6); 1.9886(9.4); 1.9081(0.3); 1.3974(0.7); 1.3508(0.3); 1.2979(2.2); 1.2583(3.0); 1.2351(2.6); 1.1922(2.3); 1.1743(4.8); 1.1565(2.2); 0.8663(0.4); 0.8537(0.6); 0.8378(0.4); -0.0002(22.2)</p>
578	1.84	<p>578: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 8.9985(2.2); 8.9780(2.3); 8.5049(8.6); 8.4947(2.0); 8.4861(1.8); 8.4710(1.5); 8.1238(1.0); 8.1171(1.8); 8.1003(1.0); 7.6592(3.0); 7.6544(5.7); 7.6497(3.2); 7.5218(1.8); 7.4987(3.4); 7.4750(10.7); 7.4705(9.2); 7.2997(2.3); 7.2817(2.5); 7.1770(1.1); 7.1734(1.1); 7.1561(2.4); 7.1383(1.5); 7.1350(1.4); 6.9084(1.7); 6.8916(3.0); 6.8733(1.4); 6.8711(1.4); 6.7964(3.3); 6.7761(3.0); 5.7570(13.6); 5.2638(0.6); 5.2483(1.5); 5.2298(1.5); 5.2142(0.7); 4.9160(1.7); 4.9034(4.0); 4.8907(1.9); 4.2892(0.4); 4.2697(1.7); 4.2614(2.4); 4.2520(3.0); 4.2376(1.8); 4.2191(0.4); 4.0557(0.6); 4.0379(1.9); 4.0201(1.9); 4.0023(0.6); 3.6763(1.0); 3.6615(3.2); 3.6485(4.3); 3.6362(2.3); 3.6094(2.1); 3.5974(3.8); 3.5842(2.9); 3.5725(0.9); 3.3230(35.7); 2.6747(0.4); 2.6706(0.5); 2.6663(0.4); 2.5238(1.2); 2.5059(68.9); 2.5015(90.7); 2.4971(65.0); 2.3284(0.5); 2.3240(0.4); 2.1790(0.5); 2.1660(0.6); 2.1552(0.8); 2.1422(1.1); 2.1265(0.9); 2.1138(0.4); 2.0744(0.4); 2.0596(1.1); 2.0484(1.0); 2.0333(0.7); 2.0239(0.7); 2.0148(0.6); 2.0076(0.4); 1.9971(0.3); 1.9888(6.2); 1.3971(16.0); 1.2586(0.4); 1.1925(2.1); 1.1747(4.2); 1.1568(2.0); -0.0002(3.7)</p>

[1923]

<p>579: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0615(0.4); 9.0402(0.5); 8.9800(7.6); 8.6025(1.7); 8.5834(5.4); 8.5682(5.9); 8.5445(5.4); 8.5056(1.2); 8.4832(15.4); 8.4772(16.0); 8.4524(0.5); 8.4436(0.4); 8.4293(0.3); 8.1268(3.0); 8.1146(2.0); 8.0994(2.0); 8.0864(3.4); 7.6673(1.6); 7.6596(2.1); 7.6507(2.3); 7.6445(3.2); 7.6391(3.2); 7.6309(3.2); 7.6236(3.2); 7.6180(3.2); 7.6113(2.0); 7.6033(1.7); 7.5953(1.4); 7.5580(5.5); 7.5351(10.2); 7.5124(5.4); 7.4985(1.0); 7.4754(1.7); 7.3275(0.5); 7.3007(7.9); 7.2816(8.6); 7.2356(2.1); 7.2214(3.4); 7.2145(3.9); 7.1940(2.2); 7.1750(4.5); 7.1713(4.3); 7.1539(8.4); 7.1364(5.3); 7.1328(4.8); 6.9344(0.4); 6.9060(6.0); 6.8874(10.0); 6.8689(5.0); 6.8113(0.6); 6.7940(12.0); 6.79(18(11.6)); 6.7736(10.7); 6.7713(9.7); 5.7574(15.4); 5.2606(2.2); 5.2456(4.9); 5.2266(4.8); 5.2116(2.0); 4.9170(4.8); 4.9062(9.9); 4.9041(10.1); 4.8926(5.4); 4.8800(0.5); 4.2823(1.2); 4.2569(7.8); 4.2481(10.8); 4.2360(6.9); 4.2174(1.2); 4.2072(0.5); 4.0559(0.9); 4.0380(2.7); 4.020(3.2); 4.0024(0.9); 3.6805(3.2); 3.6666(11.4); 3.6537(15.0); 3.6414(8.3); 3.6174(4.2); 3.6062(8.8); 3.5861(10.2); 3.5835(7.1); 3.5594(1.0); 3.5452(0.4); 3.3229(55.3); 2.6798(0.6); 2.6752(1.2); 2.6707(1.2); 2.6660(1.2); 2.5240(4.0); 2.5191(6.4); 2.5106(10.2); 2.5061(214.3); 2.5016(285.4); 2.4971(201.0); 2.4926(93.2); 2.3326(1.1); 2.3283(1.6); 2.3239(1.2); 2.1891(1.0); 2.1779(2.0); 2.1654(2.1); 2.1559(2.6); 2.1423(4.1); 2.1277(3.3); 2.1137(1.4); 2.0676(1.7); 2.0536(3.7); 2.0411(3.4); 2.0261(2.4); 2.0174(2.4); 2.0082(1.9); 1.9890(12.6); 1.3971(1.9); 1.2992(2.0); 1.2588(2.8); 1.2348(1.5); 1.1924(3.3); 1.1747(6.6); 1.1569(3.2); 0.8537(0.4); 0.0081(0.4); -0.0002(12.9); -0.0081(0.4)</p>		<p>579</p> <p>1.61</p>	
<p>589: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.3204(1.1); 9.3135(1.1); 9.3003(1.2); 9.2927(1.0); 8.5653(7.4); 8.3124(1.6); 8.3036(1.4); 8.2966(1.7); 8.2873(1.7); 8.2791(0.4); 7.7025(2.2); 7.6989(2.4); 7.6825(2.7); 7.6788(2.7); 7.6719(0.8); 7.6538(3.4); 7.6470(3.3); 7.6381(6.8); 7.4567(0.8); 7.4374(1.7); 7.4275(1.6); 7.4178(1.1); 7.4076(1.0); 7.3523(2.7); 7.3323(3.6); 7.3134(0.9); 7.1863(0.9); 7.1659(2.0); 7.1482(1.2); 6.9252(1.3); 6.9067(2.2); 6.8881(1.0); 6.8028(2.7); 6.7823(2.4); 5.7568(16.0); 5.2942(0.5); 5.2792(1.2); 5.2607(1.2); 5.2464(0.6); 5.1484(0.9); 5.1392(1.6); 5.1338(1.5); 5.1246(0.8); 4.2956(0.4); 2.771(1.2); 4.2614(2.0); 4.2522(2.0); 4.2406(1.0); 4.2328(1.2); 4.2129(0.4); 4.2075(0.3); 4.0374(0.7); 4.0196(0.6); 3.6661(0.4); 3.6505(1.0); 3.6383(1.8); 3.6256(1.9); 3.5831(0.4); 3.5455(2.6); 3.3210(2.1); 3.3034(0.4); 3.0572(15.5); 2.6701(0.6); 2.6654(0.5); 2.5051(83.3); 2.5007(109.1); 2.4964(79.4); 2.3273(0.6); 2.3233(0.5); 2.2266(0.5); 2.2137(0.8); 2.2033(0.8); 2.1911(0.8); 2.1798(0.6); 2.0667(0.8); 2.0593(0.9); 2.0497(0.7); 2.0377(0.6); 2.0327(0.6); 2.0238(0.5); 1.9884(2.9); 1.2347(0.5); 1.1919(0.8); 1.1742(1.5); 1.1564(0.7); -0.0002(9.7)</p>		<p>589</p> <p>2.43</p>	
<p>590: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.3230(1.9); 9.3026(1.9); 8.7282(0.8); 8.6746(0.3); 8.5838(8.2); 8.3304(1.7); 8.3262(1.8); 8.3102(1.8); 8.3060(2.0); 7.9109(4.6); 7.9048(4.8); 7.6985(1.1); 7.6845(3.0); 7.6738(3.3); 7.6536(2.8); 7.6410(0.9); 7.6360(1.4); 7.4926(1.6); 7.4863(1.7); 7.4607(1.5); 7.4549(1.4); 7.3529(1.9); 7.3352(2.0); 7.1897(1.2); 7.1866(1.2); 7.1682(2.1); 7.1514(1.3); 7.1473(1.2); 6.9385(0.3); 6.9281(1.4); 6.9100(2.3); 6.8922(1.1); 6.8203(0.4); 6.8035(2.9); 6.7849(2.4); 5.7568(4.1); 5.2936(0.6); 5.2778(1.2); 5.2600(1.2); 5.2445(0.6); 5.1331(1.4); 4.3052(0.4); 4.2974(0.6); 4.2901(0.6); 4.2777(1.3); 4.2616(2.0); 4.2525(2.0); 4.2406(1.1); 4.2325(1.2); 4.2122(0.4); 3.6684(0.4); 3.6540(0.9); 3.6401(1.6); 3.6288(1.8); 3.5844(0.4); 3.5555(2.0); 3.5444(2.6); 3.5068(0.4); 3.4949(0.4); 3.3197(31.2); 3.0560(16.0); 3.0377(1.8); 2.6746(0.8); 2.6700(1.1); 2.6654(0.8); 2.5231(2.9); 2.5096(69.2); 2.5054(141.9); 2.5009(188.1); 2.4965(135.6); 2.4922(65.6); 2.3321(0.8); 2.3276(1.1); 2.3232(0.8); 2.2478(0.4); 2.2268(0.6); 2.2135(0.9); 2.2041(0.9); 2.1919(0.9); 2.1835(0.6); 2.0762(0.6); 2.0685(0.8); 2.0611(1.0); 2.0519(0.7); 2.0343(0.7); 2.0262(0.6); 1.9885(0.4); 1.2349(1.4); 1.2349(1.4); 0.0079(0.4); -0.0002(12.9)</p>		<p>590</p> <p>3.44</p>	

[1924]

591	3.25	<p>591: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9.3476(1.8), 9.3272(1.8), 8.7005(7.3), 8.5245(0.4), 8.3686(2.0), 8.3493(2.2), 8.2720(1.2), 7.9656(0.5), 7.9319(2.0), 7.9142(2.4), 7.8341(16.0), 7.7034(1.8), 7.6642(2.0), 7.6642(1.4), 7.3618(2.0), 7.2027(0.9), 7.1993(0.9), 7.1615(2.0), 7.1611(1.2), 6.9518(1.3), 6.9330(2.3), 6.9146(1.2), 6.8173(2.8), 6.7968(2.5), 5.7572(12.0), 5.3147(0.5), 5.3002(1.2), 5.2813(1.3), 5.2664(0.6), 5.1438(1.1), 5.1288(2.4), 5.1136(1.1), 4.3120(0.4), 4.3050(0.4), 4.2928(1.2), 4.2757(1.9), 4.2668(1.9), 4.2535(1.1), 4.2460(1.3), 4.2258(0.4), 4.2188(0.4), 4.0382(0.9), 4.0204(0.9), 3.6465(1.0), 3.6333(2.4), 3.6200(2.6), 3.6066(1.4), 3.5492(2.4), 3.5372(2.9), 3.3260(25.5), 3.3049(0.4), 3.0624(14.0), 2.5058(36.3), 2.5017(45.5), 2.4977(33.2), 2.2521(0.4), 2.2430(0.5), 2.2305(0.8), 2.2209(0.8), 2.2089(0.9), 2.1975(0.7), 2.1887(0.4), 2.1046(0.6), 2.0965(0.8), 2.0895(0.9), 2.0738(0.7), 2.0620(0.6), 2.0537(0.6), 1.9891(3.8), 1.2320(0.3), 1.1926(1.0), 1.1748(1.9), 1.1572(1.0), -0.0001(4.5)</p>
595	3.61	<p>595: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9.1408(0.9), 9.1232(1.7), 9.1128(1.2), 9.1059(1.3), 8.5911(7.4), 8.3494(1.9), 8.3335(2.1), 8.3258(2.1), 8.3102(1.9), 8.1409(0.4), 7.7554(3.0), 7.7518(3.1), 7.7353(3.7), 7.7317(3.6), 7.6777(2.3), 7.6551(3.9), 7.6324(2.2), 7.5002(1.4), 7.4897(1.3), 7.4808(2.9), 7.4702(2.7), 7.4610(1.8), 7.4505(1.6), 7.4116(1.0), 7.4079(1.1), 7.3993(1.1), 7.3919(1.8), 7.3883(1.6), 7.3754(1.7), 7.3681(1.2), 7.3560(2.0), 7.3479(1.6), 7.3377(1.5), 7.3327(1.4), 7.1785(1.3), 7.1608(2.8), 7.1431(1.7), 6.9110(1.4), 6.8927(2.5), 6.8746(1.2), 6.7951(3.5), 6.7747(3.2), 5.7569(16.0), 5.2309(1.4), 5.2174(1.3), 4.2882(0.5), 4.2691(1.6), 4.2537(2.7), 4.2444(2.3), 4.2032(1.3), 4.2033(0.4), 4.0557(0.6), 4.0378(1.6), 4.0201(1.6), 4.0023(0.6), 3.7509(0.6), 3.7434(0.5), 3.7279(1.0), 3.7217(1.2), 3.7117(0.7), 3.7041(1.5), 3.6822(1.2), 3.6640(0.7), 3.6542(0.7), 3.6478(1.1), 3.6339(1.7), 3.6281(1.2), 3.6209(1.1), 3.6138(1.3), 3.6008(1.6), 3.5817(2.2), 3.5630(1.8), 3.5434(0.5), 3.3865(0.6), 3.3682(1.5), 3.3552(1.7), 3.3473(2.1), 3.3228(4.3), 2.960(0.8), 3.2790(0.6), 3.2636(1.0), 3.2544(1.1), 3.2470(1.0), 3.2390(1.1), 3.2120(1.6), 3.1913(1.2), 3.1782(1.4), 3.1674(0.5), 3.1565(0.9), 3.1462(0.7), 3.1236(0.4), 3.0852(14.4), 3.0806(13.3), 2.6985(1.0), 2.6799(1.2), 2.6746(1.3), 2.6704(1.5), 2.5233(2.1), 2.5057(103.8), 2.5013(135.2), 2.4969(96.5), 2.3325(0.6), 2.3281(0.8), 2.2037(0.7), 2.1932(0.9), 2.1822(1.1), 2.1701(1.0), 2.1617(0.8), 2.1490(0.5), 2.0299(1.2), 2.0158(1.4), 1.9887(8.2), 1.9661(1.1), 1.9539(0.6), 1.4852(0.6), 1.4798(0.6), 1.4688(1.0), 1.4532(1.1), 1.4363(0.9), 1.4216(0.6), 1.2352(0.5), 1.1923(1.8), 1.1745(3.6), 1.1567(1.8), 0.0075(0.3), -0.0002(9.6)</p>
596	2.30	<p>596: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9.0701(3.4), 9.0498(3.5), 8.5625(0.6), 8.5278(0.5), 8.4640(2.2), 8.4489(2.6), 8.4390(11.6), 8.4253(2.3), 8.1352(0.7), 7.8085(0.8), 7.7955(1.7), 7.7759(1.8), 7.7613(0.9), 7.7046(6.4), 7.6992(7.6), 7.6691(0.7), 7.6622(1.0), 7.6543(0.9), 7.6470(1.4), 7.6418(1.4), 7.6338(1.4), 7.6213(1.4), 7.6135(0.9), 7.5969(2.8), 7.5738(4.2), 7.5512(2.2), 7.5390(0.3), 7.4597(6.8), 7.4558(6.8), 7.4405(0.4), 7.2706(2.3), 7.2503(2.8), 7.2145(1.7), 7.1920(0.9), 7.1737(1.8), 7.1528(3.5), 7.1353(2.1), 6.8948(1.7), 6.8760(2.8), 6.8579(1.3), 6.7898(4.9), 6.7697(4.4), 6.2235(4.2), 6.2186(7.2), 6.2137(4.2), 6.1947(0.4), 5.7572(15.7), 5.2260(1.1), 5.2118(2.2), 5.1921(2.1), 5.1777(0.9), 4.4811(3.3), 4.4655(7.5), 4.4500(3.9), 4.4309(0.4), 4.2266(4.2), 4.2215(4.5), 4.0560(1.1), 4.0380(3.4), 4.0202(3.4), 4.0023(1.2), 3.8362(3.8), 3.8227(3.4), 3.3218(25.8), 2.8900(0.6), 2.7311(0.6), 2.6707(1.0), 2.5236(2.6), 2.5057(130.4), 2.5014(170.3), 2.4971(122.6), 2.3282(1.0), 2.1418(0.9), 2.1256(1.2), 2.1084(1.4), 2.0941(1.3), 2.0746(0.7), 2.0126(1.0), 1.9999(1.6), 1.9888(16.0), 1.9666(1.0), 1.9535(0.7), 1.2347(0.6), 1.1924(3.8), 1.1746(7.5), 1.1568(3.7), 0.0080(0.4), -0.0001(12.0)</p>
597	1.84	<p>597: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 9.0160(2.4), 8.9955(2.4), 8.5800(1.6), 8.5647(1.7), 8.5564(1.7), 8.5410(1.7), 8.5257(8.0), 8.2056(1.8), 7.6979(16.0), 7.5619(1.8), 7.5385(3.3), 7.5151(1.7), 7.2990(2.3), 7.2808(2.6), 7.1797(1.1), 7.1764(1.2), 7.1586(2.4), 7.1412(1.5), 6.9103(1.7), 6.8921(2.9), 6.8735(1.4), 6.7965(3.3), 6.7784(3.0), 5.2605(0.7), 5.2452(1.5), 5.2258(1.5), 5.2103(0.6), 4.9247(1.7), 4.9122(3.9), 4.8996(1.8), 4.2873(0.3), 4.2603(2.4), 2.512(3.2), 4.2197(0.4), 3.6760(0.9), 3.6623(3.1), 3.6494(4.2), 3.6376(2.3), 3.6131(2.2), 3.6014(3.8), 3.5894(2.8), 3.3245(128.5), 2.6710(0.9), 2.5058(125.4), 2.5015(161.2), 2.4973(117.7), 2.3284(0.9), 2.1769(0.5), 2.1553(0.8), 2.1416(1.1), 2.1263(1.0), 2.1128(0.5), 2.0598(1.1), 2.0478(1.1), 2.0324(0.8), 2.0239(0.7), 2.0143(0.6), -0.0001(5.0)</p>

[1925]

599	1.26	<p>599: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.0562(3.0); 9.0349(3.1); 8.5743(0.4); 8.4690(1.5); 8.4526(1.9); 8.4440(1.9); 8.4303(1.6); 8.3837(8.0); 8.1530(1.3); 7.9531(0.3); 7.8091(1.4); 7.7969(1.3); 7.7809(1.2); 7.7236(3.8); 7.7207(3.8); 7.7033(4.5); 7.6096(1.1); 7.5735(2.2); 7.5518(3.6); 7.5294(2.0); 7.4708(1.4); 7.4608(1.8); 7.4511(3.2); 7.4413(3.2); 7.4317(1.7); 7.4217(1.9); 7.3433(2.1); 7.3279(3.6); 7.3127(2.0); 7.2532(3.2); 7.2358(3.5); 7.2145(0.4); 7.1976(0.5); 7.1703(2.3); 7.1507(4.4); 7.1322(2.8); 6.9427(0.3); 6.8980(2.9); 6.8795(4.7); 6.8617(2.6); 6.8121(0.5); 6.7871(4.7); 6.7668(4.2); 5.7564(16.0); 5.2306(1.0); 5.2157(2.1); 5.1972(2.0); 5.1830(0.9); 4.3402(3.3); 4.2289(4.6); 3.7613(3.1); 3.5706(0.3); 3.5591(0.4); 3.5486(0.4); 3.4758(0.7); 3.3304(5.7); 3.1731(0.6); 2.8900(1.4); 2.7307(1.4); 2.6707(1.6); 2.5587(0.4); 2.5016(305.4); 2.4478(0.8); 2.4148(0.4); 2.4082(0.4); 2.3283(1.8); 2.1700(0.5); 2.1196(1.4); 1.9881(2.0); 1.1742(0.4); -0.0003(14.4)</p>
606	2.63	<p>606: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 20.0019(0.4); 11.6374(0.5); 9.3368(2.0); 9.3164(1.9); 8.6542(0.4); 8.6320(8.0); 8.3582(2.0); 8.3369(2.2); 8.1752(0.6); 8.1559(0.5); 7.7946(2.0); 7.7787(2.7); 7.7011(2.2); 7.6792(2.2); 7.6623(1.5); 7.6399(0.6); 7.6304(0.7); 7.6154(0.9); 7.6105(0.9); 7.5953(0.9); 7.5661(0.6); 7.3732(2.0); 7.3556(2.2); 7.2327(1.2); 7.2036(1.6); 7.1624(2.2); 7.1642(1.3); 6.9450(1.6); 6.9252(2.4); 6.9067(1.2); 6.8179(2.7); 6.7965(2.4); 5.3127(0.7); 5.2980(1.3); 5.2805(1.4); 5.2646(0.6); 5.1508(1.2); 5.1352(2.6); 5.1201(1.3); 4.3135(0.6); 4.3101(0.6); 4.2925(1.2); 4.2749(1.8); 4.2657(1.9); 4.2452(1.4); 4.2228(0.6); 3.6428(2.3); 3.6278(2.6); 3.6139(1.6); 3.5956(0.5); 3.5628(2.5); 3.5489(3.0); 3.3286(367.5); 3.0681(16.0); 2.6830(4.0); 2.6784(5.4); 2.6738(4.0); 2.6571(0.4); 2.5916(0.5); 2.5585(1.2); 2.5138(734.5); 2.5095(960.4); 2.5050(690.4); 2.4327(0.8); 2.3888(0.5); 2.3406(4.0); 2.3362(5.6); 2.3320(4.1); 2.2638(0.5); 2.2521(0.8); 2.2294(0.9); 2.2202(0.8); 2.2097(0.9); 2.1954(0.9); 2.1014(0.6); 2.0870(1.1); 2.0807(1.0); 2.0641(0.9); 2.0539(0.8); 1.7536(0.4); 0.0082(2.7); -2.4241(0.4); -2.6703(0.5)</p>
625	1.24	<p>625: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.0900(1.0); 9.0696(1.1); 8.5142(4.0); 8.3294(1.0); 8.3092(1.0); 7.7732(0.5); 7.7612(2.0); 7.7455(1.8); 7.6202(3.0); 7.6160(7.0); 7.6102(2.8); 7.6064(1.8); 7.5945(2.0); 7.5821(1.0); 7.5610(1.1); 7.5428(0.8); 7.2876(1.0); 7.2700(1.0); 7.1885(0.5); 7.1848(0.5); 7.1681(1.0); 7.1501(0.6); 7.1463(0.6); 7.1283(2.2); 6.9241(0.7); 6.9055(1.3); 6.8966(0.7); 6.8599(2.3); 6.8053(1.4); 6.7852(1.3); 5.7568(16.0); 5.2445(0.6); 5.2257(0.6); 4.3461(0.9); 4.3314(2.0); 4.3165(1.0); 4.2612(1.0); 4.2481(1.1); 4.2348(1.1); 3.7783(1.0); 3.7693(0.9); 3.7633(0.9); 3.3256(1.1); 3.1318(1.5); 2.5236(0.7); 2.5101(1.9); 2.5058(40.5); 2.5013(54.2); 2.4968(38.5); 2.4925(18.1); 2.1600(0.3); 2.1388(0.5); 2.1255(0.5); 2.0744(0.4); 2.0394(0.4); 2.0254(0.5); 2.0027(0.3); 0.0079(0.7); -0.0002(21.3); -0.0084(0.7)</p>
629	2.09	<p>629: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 8.9739(1.9); 8.9538(1.9); 8.5544(0.4); 8.3842(2.7); 8.3611(3.0); 8.3534(6.7); 8.9071(1.2); 7.8785(1.2); 7.6553(3.6); 7.6515(2.8); 7.6466(4.6); 7.6418(2.6); 7.6325(3.3); 7.3204(1.6); 7.2981(2.8); 7.2783(1.9); 7.1724(0.9); 7.1505(1.7); 7.1331(1.2); 7.1292(1.1); 6.9069(1.3); 6.8885(2.2); 6.8727(1.1); 6.7876(2.5); 6.7691(2.1); 5.2365(0.6); 5.2227(1.1); 5.2020(1.0); 5.1865(0.5); 4.2514(1.9); 4.2395(3.2); 4.2256(1.8); 3.3205(162.9); 3.0650(1.7); 3.0510(6.7); 3.0385(6.8); 2.6746(1.3); 2.6702(1.7); 2.6658(1.3); 2.5456(0.4); 2.5233(4.5); 2.5098(111.1); 2.5055(228.2); 2.5011(302.5); 2.4966(215.4); 2.4923(102.0); 2.3324(1.2); 2.3278(1.7); 2.3236(1.2); 2.1786(0.4); 2.1705(0.6); 2.1564(0.7); 2.1345(0.8); 2.1206(0.8); 2.1072(0.3); 2.0227(0.7); 2.0119(0.9); 1.9896(0.6); 1.9757(0.6); 1.3975(16.0); 1.2981(0.4); 1.2580(0.6); 1.2351(3.6); 0.8536(0.5); 0.0078(1.2); -0.0002(36.1); -0.0084(1.4)</p>
630	5.59	<p>630: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.0221(2.2); 9.0014(2.2); 8.6578(9.6); 8.2917(3.5); 8.2688(4.0); 7.7935(4.4); 7.7706(4.1); 7.6936(2.7); 7.6889(5.3); 7.6841(2.9); 7.3740(3.2); 7.3575(3.9); 7.2960(0.5); 7.2779(1.4); 7.2596(5.4); 7.2490(2.8); 7.2439(2.0); 7.2315(1.8); 7.2267(1.4); 7.2158(0.7); 7.2100(0.7); 7.1679(3.4); 6.7889(0.4); 5.7565(13.4); 5.6226(0.6); 5.6026(1.6); 5.5824(1.6); 5.5623(0.6); 3.9159(0.5); 3.8839(6.4); 3.8527(0.5); 3.3624(0.7); 3.3515(1.3); 3.3314(2.0); 3.3200(16.7); 3.2889(1.5); 3.2793(2.4); 3.2661(1.7); 3.2475(1.7); 3.2366(0.7); 2.6747(0.4); 2.6701(0.6); 2.6658(0.4); 2.5236(1.4); 2.5100(39.3); 2.5057(82.0); 2.5012(109.3); 2.4967(78.5); 2.4924(37.7); 2.4266(1.5); 2.4077(1.6); 2.3956(1.7); 2.3767(1.5); 2.3323(0.5); 2.3280(0.6); 2.3233(0.5); 1.9885(0.7); 1.8670(1.4); 1.8451(1.4); 1.8359(1.4); 1.8144(1.2); 1.3617(16.0); 1.2982(0.6); 1.2883(0.8); 1.2329(1.9); 1.2207(14.1); 1.1928(0.4); 1.1747(0.5); 0.8528(0.3); 0.0081(0.4); -0.0002(13.8); -0.0083(0.5)</p>

[1926]

<p>635</p>	<p>4.08</p>	<p>635: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 16.1140(0.5); 10.4114(5.2); 9.2742(4.1); 9.2545(4.1); 8.6672(16.0); 8.4994(0.8); 8.3161(0.7); 8.2805(5.8); 8.2574(6.8); 7.9468(0.5); 7.8498(0.5); 7.8211(0.5); 7.8071(1.9); 7.7922(13.1); 7.7695(10.8); 7.7494(1.6); 7.7007(4.7); 7.6894(5.4); 7.6846(12.3); 7.6801(10.0); 7.6549(0.5); 7.6283(0.5); 7.5660(2.6); 7.5463(3.9); 7.5265(1.9); 7.4103(0.6); 7.3731(7.7); 7.3420(0.5); 7.2955(0.6); 7.2790(0.5); 7.2579(0.5); 7.1748(0.6); 7.1587(0.5); 6.9763(2.6); 6.9717(4.9); 6.9672(2.8); 6.7934(10.6); 6.7888(10.5); 6.7571(3.0); 6.7200(1.4); 5.7123(1.4); 5.7007(2.3); 5.6927(2.3); 5.6827(1.4); 5.6722(1.3); 4.2620(0.6); 3.9041(0.7); 3.8714(10.6); 3.8595(8.3); 3.3202(437.6); 3.2547(10.3); 3.2474(9.8); 3.2274(3.3); 3.2003(3.5); 3.1809(2.7); 3.0551(0.6); 3.0434(0.7); 3.0415(0.8); 3.0359(1.0); 3.0236(1.1); 2.6887(0.9); 2.6736(7.4); 2.6705(7.5); 2.6637(7.5); 2.6262(2.8); 2.6181(3.1); 2.5684(1.0); 2.5234(15.1); 2.5055(828.6); 2.5011(1116.3); 2.4966(810.8); 2.4925(396.0); 2.3321(4.3); 2.3276(6.2); 2.3235(4.8); 1.6275(0.5); 1.5493(0.6); 1.3738(0.7); 1.3611(0.6); 1.3526(0.7); 1.3364(0.7); 1.3137(0.6); 1.2976(3.0); 1.2584(4.5); 1.2492(1.9); 1.2336(4.7); 1.1866(0.7); 1.1670(0.7); 1.1470(0.5); 0.8837(0.6); 0.8665(1.0); 0.8532(1.2); 0.8343(0.9); 0.7968(0.5); 0.0080(3.9); -0.0001(140.0); -0.0082(16.0); -0.1495(0.7)</p>
<p>636</p>	<p>1.89</p>	<p>636: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 8.9971(1.4); 8.9919(1.4); 8.9766(1.4); 8.9719(1.4); 8.5599(0.3); 8.5003(0.6); 8.4458(2.8); 8.4226(3.0); 8.3554(7.4); 8.3047(0.3); 8.0757(1.1); 8.0706(0.5); 8.0539(1.2); 7.9316(0.8); 7.9195(1.1); 7.9128(1.1); 7.9002(0.8); 7.6950(3.1); 7.6724(3.0); 7.6539(0.6); 7.6428(0.5); 7.6285(0.9); 7.6152(0.9); 7.6017(0.9); 7.5872(0.4); 7.5792(0.4); 7.4949(0.8); 7.4737(0.7); 7.3020(1.7); 7.2826(1.7); 7.1716(1.2); 7.1510(2.4); 7.1329(1.9); 7.1156(0.9); 7.0876(0.6); 6.9221(0.3); 6.9074(1.5); 6.8887(2.4); 6.8702(1.2); 6.7886(3.0); 6.7683(2.6); 5.7565(1.4); 5.2367(0.7); 5.2226(1.4); 5.2034(1.3); 5.1877(0.6); 4.2500(2.2); 4.2396(3.3); 4.2272(2.0); 3.3214(36.9); 3.0794(2.4); 3.0597(4.7); 3.0529(5.6); 3.0474(5.6); 3.0406(4.9); 3.0261(0.9); 2.6705(0.8); 2.6665(0.6); 2.5422(0.5); 2.5379(0.5); 2.5324(0.4); 2.5238(1.9); 2.5102(57.4); 2.5061(114.6); 2.5017(149.9); 2.4973(108.3); 2.3331(0.6); 2.3287(0.8); 2.3240(0.7); 2.1869(0.4); 2.1731(0.8); 2.1589(0.9); 2.1531(0.7); 2.1394(0.9); 2.1240(0.9); 2.1119(0.4); 2.0419(0.4); 2.0252(0.8); 2.0171(0.9); 2.0075(0.9); 1.9889(0.9); 1.9713(0.5); 1.3979(16.0); 1.2984(0.6); 1.2590(0.9); 1.2353(1.0); 1.1749(0.4); 0.8534(0.4); 0.1464(0.6); 0.0362(0.5); 0.0081(6.1); 0.0000(147.3); -0.0077(6.7); -0.0332(0.4); -0.1494(0.7)</p>
<p>637</p>	<p>2.00</p>	<p>637 (阻转异构体 (Atopisomer) 1): ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ = 8.9812(3.0); 8.9606(3.1); 8.5585(2.1); 8.5432(2.2); 8.5347(2.2); 8.5195(2.0); 8.4472(1.0); 8.3740(10.8); 8.5885(1.3); 7.8460(2.4); 7.8330(1.3); 7.7210(3.3); 7.7173(3.5); 7.7009(4.0); 7.6972(4.0); 7.5268(2.4); 7.5043(4.0); 7.4818(2.7); 7.4707(3.7); 7.4513(6.4); 7.4315(3.6); 7.3428(4.1); 7.3391(4.3); 7.3237(3.3); 7.3200(3.0); 7.2841(2.8); 7.2656(3.1); 7.1683(1.4); 7.1645(1.4); 7.1474(2.9); 7.1298(1.8); 7.1259(1.7); 6.9122(0.3); 6.9043(2.1); 6.9019(2.2); 6.8834(3.6); 6.8671(1.7); 6.8646(1.7); 6.7869(4.0); 6.7664(3.6); 6.5264(1.2); 5.7564(10.6); 5.2486(1.0); 5.2332(1.9); 5.2138(1.8); 5.1993(0.8); 4.2563(3.3); 4.2421(5.3); 4.2296(3.1); 4.0381(0.5); 4.0202(0.5); 3.5676(1.2); 3.5530(1.0); 3.5354(3.3); 3.5218(3.7); 3.5179(3.7); 3.5043(3.3); 3.4865(1.0); 3.3244(162.6); 2.6748(0.7); 2.6705(1.0); 2.6659(0.7); 2.5238(2.2); 2.5189(3.5); 2.5103(62.0); 2.5059(130.8); 2.5015(175.3); 2.4970(125.4); 2.4927(59.8); 2.3326(1.0); 2.3240(10.7); 2.3218(1.0); 2.3210(0.9); 2.1540(0.9); 2.1492(1.0); 2.1351(1.7); 2.1215(1.5); 2.1070(0.5); 2.0365(0.6); 2.0236(1.4); 2.0079(1.5); 1.9886(3.0); 1.9756(0.8); 1.9606(0.4); 1.3973(1.0); 1.2982(0.6); 1.2779(7.4); 1.2600(16.0); 1.2422(7.8); 1.2362(2.8); 1.1924(0.7); 1.1745(1.4); 1.1568(0.7); 1.1179(0.4); 0.1460(0.7); 0.0079(5.2); -0.0002(164.7); -0.0085(16.1); -0.1496(0.8)</p>

[1927]

637	2.00	<p>637 (阻转异构体 2): ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 8.981(3.2); 8.9607(3.1); 8.5886(2.0); 8.5432(2.5); 8.5346(2.2); 8.5195(2.0); 8.4528(0.5); 8.4472(1.0); 8.3793(4.0); 8.3740(1.0); 7.891(0.4); 7.8462(2.8); 7.8341(1.5); 7.7210(3.6); 7.7173(3.4); 7.7009(4.4); 7.6971(3.8); 7.5269(2.3); 7.5044(4.0); 7.4817(2.8); 7.4763(1.8); 7.4707(3.8); 7.4564(2.4); 7.4512(6.1); 7.4370(1.4); 7.4315(3.4); 7.3722(0.4); 7.3429(4.6); 7.3392(4.1); 7.3238(3.5); 7.3201(2.9); 7.2866(3.1); 7.2675(3.4); 7.1684(1.7); 7.1647(1.5); 7.1491(3.3); 7.1299(2.1); 7.1260(1.7); 6.9045(2.3); 6.9017(2.3); 6.8858(3.8); 6.8672(1.8); 6.8647(1.6); 6.7871(4.2); 6.7666(3.8); 6.5259(1.0); 5.7618(3.4); 5.7564(9.6); 5.2477(1.1); 5.2335(2.3); 5.2150(2.0); 5.1991(0.8); 4.256(4.1); 4.2423(5.9); 4.2302(3.3); 4.0378(0.5); 4.0201(0.5); 3.5734(0.5); 3.5677(1.2); 3.5530(1.3); 3.5355(3.7); 3.5222(4.6); 3.5181(4.1); 3.5044(3.6); 3.4867(1.0); 3.3292(56.4); 3.3241(147.2); 2.6749(1.0); 2.6704(1.0); 2.5100(97.7); 2.5060(162.3); 2.5014(184.8); 2.4969(125.4); 2.3326(0.9); 2.3282(1.0); 2.1711(1.0); 2.1543(1.2); 2.1482(1.2); 2.1349(1.8); 2.1213(1.6); 2.1069(0.6); 2.0234(1.7); 2.0079(1.8); 1.9942(1.9); 1.9885(3.2); 1.9758(1.0); 1.3973(1.0); 1.2984(0.7); 1.2778(7.7); 1.2650(7.0); 1.2599(16.0); 1.2421(8.2); 1.1924(0.8); 1.1803(0.7); 1.1746(1.4); 1.1624(0.5); 1.1566(0.8); 1.1175(0.4); 0.8531(0.3); 0.1461(0.7); 0.0054(57.5); -0.0002(161.4); -0.0084(7.7); -0.1496(0.7)</p>
638	2.23	<p>638: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0006(3.2); 8.9802(3.2); 8.5200(2.1); 8.5049(2.3); 8.4962(2.3); 8.4812(2.3); 8.4700(1.1); 7.9621(1.4); 7.9491(2.6); 7.9360(1.4); 7.656(9.0); 7.6521(7.7); 7.6473(4.4); 7.5206(2.6); 7.4975(4.7); 7.4688(12.2); 7.2968(3.0); 7.2782(3.2); 7.1784(1.5); 7.1750(1.5); 7.1575(3.0); 7.1400(1.9); 7.1363(1.8); 6.9153(2.2); 6.8968(3.8); 6.8803(1.8); 6.8780(1.8); 6.7978(4.2); 6.7776(3.9); 5.7568(14.4); 5.2612(0.4); 5.2462(1.9); 5.2271(1.9); 5.2124(0.8); 4.2879(0.4); 4.2684(2.9); 4.2535(5.0); 4.2416(3.2); 4.2248(0.4); 4.0559(0.5); 4.0381(1.4); 4.0204(1.4); 4.0025(0.5); 3.5657(1.0); 3.5479(3.4); 3.5341(3.8); 3.5305(3.9); 3.5167(3.4); 3.4992(1.0); 3.3244(45.5); 2.6751(0.3); 2.6708(0.4); 2.6664(0.3); 2.5240(1.0); 2.5062(58.1); 2.5018(77.3); 2.4974(55.4); 2.4933(26.6); 2.3284(0.4); 2.3242(0.3); 2.1917(0.4); 2.1800(0.8); 2.1675(0.8); 2.1582(1.0); 2.1439(1.7); 2.1299(1.4); 2.1160(0.6); 2.0571(0.6); 2.0444(1.4); 2.0300(1.4); 2.0169(0.9); 2.0079(1.0); 1.9976(0.8); 1.9889(6.3); 1.3966(2.5); 1.2716(7.6); 1.2537(16.0); 1.2359(7.6); 1.1928(1.6); 1.1750(3.2); 1.1572(1.6); 1.1006(0.4); 0.1459(0.4); 0.0078(2.9); -0.0002(85.1); -0.0085(3.2); -0.1498(0.4)</p>
639	2.03	<p>639: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0037(3.5); 8.9833(3.6); 8.5928(2.3); 8.5776(2.5); 8.5692(2.5); 8.5540(2.3); 8.4447(8.2); 7.9683(0.9); 7.9555(1.6); 7.9411(1.6); 7.9269(1.7); 7.9141(0.9); 7.6638(0.8); 7.6556(0.8); 7.6367(1.6); 7.6280(1.5); 7.6154(1.5); 7.6000(0.8); 7.5928(0.6); 7.5575(2.4); 7.5348(4.5); 7.5123(2.4); 7.2980(3.6); 7.2784(4.0); 7.2281(1.0); 7.2073(1.8); 7.1856(1.1); 7.1760(2.3); 7.1556(3.8); 7.1373(2.3); 6.9128(2.6); 6.8941(4.4); 6.8755(2.1); 6.7945(5.2); 6.7742(4.7); 5.7562(7.5); 5.2574(1.0); 5.2421(2.3); 5.2232(2.3); 5.2089(1.0); 4.2637(3.6); 4.2504(6.3); 4.2383(3.7); 4.0560(0.4); 4.0382(1.2); 4.0202(1.2); 4.0029(0.4); 3.5615(0.9); 3.5447(2.8); 3.5317(4.0); 3.5142(2.9); 3.3254(108.5); 2.6706(0.7); 2.5017(124.2); 2.3283(0.7); 2.1918(0.5); 2.1788(1.1); 2.1587(1.2); 2.1432(2.0); 2.1298(1.7); 2.1157(0.7); 2.1035(1.5); 2.0224(1.6); 2.0015(1.1); 1.9887(6.0); 1.3972(0.8); 1.2987(0.3); 1.2755(7.7); 1.2577(16.0); 1.2399(8.0); 1.1925(1.4); 1.1748(2.8); 1.1570(1.4); 1.1112(0.4); 0.1461(0.5); -0.0003(106.4); -0.1497(0.5)</p>
640	2.48	<p>640: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0190(2.7); 8.9986(2.8); 8.5860(1.9); 8.5708(1.8); 8.5624(1.9); 8.5471(1.6); 8.4860(8.4); 8.4794(1.3); 8.4515(0.7); 8.4433(0.4); 8.2878(0.5); 8.2279(2.1); 8.0387(1.2); 8.0254(2.1); 8.0125(1.1); 7.7914(0.8); 7.6916(16.0); 7.5748(0.5); 7.5631(1.8); 7.5519(0.4); 7.5398(3.4); 7.5166(1.7); 7.2969(2.4); 7.2786(2.7); 7.1814(1.1); 7.1778(1.2); 7.1606(2.5); 7.1428(1.6); 6.9190(1.7); 6.9002(3.0); 6.8820(1.5); 6.7996(3.4); 6.7792(3.1); 5.7593(6.7); 5.2566(0.7); 5.2422(1.7); 5.2228(1.7); 5.2079(0.8); 4.2673(2.5); 4.2411(2.9); 4.2300(4.4); 4.0382(0.5); 4.0200(0.5); 3.5675(1.1); 3.5501(2.9); 3.5331(3.2); 3.5189(2.7); 3.5015(0.8); 3.3250(141.3); 2.5059(106.3); 2.5018(136.0); 2.4976(97.9); 2.3285(0.7); 2.1793(0.7); 2.1585(0.9); 2.1438(1.4); 2.1299(1.2); 2.1299(1.2); 2.0302(1.2); 2.0171(0.8); 2.0082(0.9); 1.9888(2.3); 1.3974(1.0); 1.2982(0.3); 1.2718(5.9); 1.2620(2.4); 1.2539(12.0); 1.1928(6.0); 1.1750(1.1); 1.1571(0.6); 0.1446(0.6); 0.0073(4.4); -0.0001(110.9); -0.0082(4.5); -0.1496(0.6)</p>

[1928]

641	1.92	<p>641: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.072(0.5);9.0637(0.6);8.4190(0.8);8.4096(1.8);8.4004(2.2);7.7346(0.4);7.6795(1.2);7.6757(1.2);7.6593(1.2);7.6558(1.2);7.5940(0.5);7.5815(2.6);7.5618(1.4);7.5440(0.4);7.4389(0.5);7.4315(0.5);7.4194(0.9);7.4111(0.8);7.4002(0.5);7.3915(0.5);7.3174(0.7);7.3021(1.5);7.2863(1.2);7.1704(0.5);7.1530(1.0);7.1323(0.6);6.9077(0.7);6.8882(1.2);6.8702(0.6);6.7922(1.4);6.7715(1.2);5.2376(0.6);5.2210(0.6);4.2559(2.4);4.2484(2.3);3.7210(1.3);3.7090(0.9);3.3195(59.6);2.6702(1.5);2.5231(3.5);2.5054(198.0);2.5011(259.6);2.4968(186.2);2.3320(1.1);2.3277(1.5);2.1827(0.3);2.1601(0.4);2.1464(0.6);2.1325(0.5);2.0385(0.4);2.0240(0.5);1.9970(1.1);1.9022(1.6);1.3977(16.0);0.1461(1.0);0.0077(7.6);-0.0002(219.7);-0.0081(8.5);-0.1498(1.1)</p>
644	2.03	<p>644: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1762(2.1);9.1562(2.2);8.6798(7.4);7.9799(1.3);7.9643(1.5);7.9565(1.5);7.9407(1.4);7.6877(2.4);7.6832(4.5);7.6479(3.0);7.5660(1.5);7.5426(2.8);7.5196(1.4);7.4951(8.0);7.4914(7.9);7.3265(2.0);7.3076(2.2);7.1882(1.1);7.1662(4.4);7.1530(1.6);6.9288(1.5);6.9104(2.5);6.8919(1.2);6.8417(3.1);6.8047(2.9);6.7842(2.6);5.2372(0.6);5.2228(1.3);5.2037(1.3);5.1892(0.6);4.3111(2.0);4.2962(4.0);4.2811(2.3);4.2538(1.2);4.2359(1.7);4.2269(1.8);4.2119(1.1);4.2052(1.3);4.1841(0.4);4.0378(0.5);4.0200(0.6);3.5379(2.0);3.5229(3.8);3.5078(1.9);3.3232(6.1);3.0749(16.0);2.8662(2.9);2.6705(0.7);2.5480(0.8);2.5053(97.3);2.5014(124.4);2.3284(0.7);2.2069(0.4);2.1981(0.6);2.1838(0.8);2.1745(0.8);2.1629(0.8);2.1517(0.6);2.0745(3.5);2.0303(0.9);2.0162(0.7);2.0025(0.6);1.9887(2.6);1.2341(0.9);1.1924(0.6);1.1746(1.2);1.1568(0.6);-0.0001(61.3)</p>
647	3.90	<p>647: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.2469(1.6);9.2267(1.7);8.7138(6.9);8.4548(3.2);8.3695(1.3);8.3539(1.4);8.3458(1.4);8.3303(1.3);7.7363(2.2);7.7312(2.4);7.6970(2.2);7.6921(4.6);7.6877(3.4);7.6656(2.6);7.6424(1.4);7.6381(0.9);7.6330(1.2);7.6280(0.6);7.5214(6.3);7.5172(6.1);7.3823(1.5);7.3649(1.6);7.1937(0.8);7.1902(0.8);7.1728(1.6);7.1552(1.0);7.1517(1.0);6.9391(1.1);6.9366(1.2);6.9180(2.0);6.9019(1.0);6.8993(1.0);6.8088(2.2);6.8068(2.2);6.7884(2.0);6.7863(2.0);5.7561(12.1);5.2495(0.4);5.2362(1.0);5.2167(1.0);5.2022(1.7);4.0024(0.6);3.7243(0.9);3.7057(2.1);4.2546(1.8);4.2458(1.6);4.2339(0.9);4.2262(1.0);4.2061(0.3);4.0558(0.6);4.0380(1.7);4.0202(1.7);4.0024(0.6);3.7243(0.9);3.7057(2.1);3.6886(2.0);3.6540(0.4);3.6195(1.1);3.6034(2.2);3.5864(1.6);3.5681(0.8);3.5517(0.4);3.3229(30.8);3.0469(13.3);3.0228(0.8);2.9728(16.0);2.9526(0.6);2.6705(0.4);2.5240(0.9);2.5104(24.8);2.5061(52.1);2.5016(69.8);2.4971(49.8);2.4928(23.6);2.3283(0.4);2.2263(0.3);2.2177(0.4);2.2054(0.6);2.1949(0.6);2.1835(0.7);2.1718(0.5);2.0912(0.5);2.0835(0.6);2.0764(0.8);2.0614(0.5);2.0499(0.5);2.0418(0.5);1.9888(7.6);1.1927(2.0);1.1749(4.0);1.1571(1.9);0.0079(0.6);-0.0002(19.9);-0.0065(0.7)</p>
648	2.06	<p>648: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.0572(2.9);9.0367(2.9);8.4493(10.6);8.1700(2.0);8.1550(2.1);8.1463(2.1);8.1314(2.0);7.7359(0.7);7.7309(0.8);7.6651(3.6);7.6604(7.0);7.6556(4.0);7.6378(0.4);7.6329(0.5);7.4698(11.0);7.4519(2.4);7.4287(4.1);7.4056(2.1);7.3170(2.8);7.2990(3.1);7.1870(1.4);7.1840(1.4);7.1665(2.9);7.1487(1.8);7.1452(1.7);6.9224(2.0);6.9044(3.5);6.8874(1.7);6.8060(4.0);6.7857(3.6);5.7560(16.0);5.5709(0.8);5.5640(1.0);5.5582(0.9);5.4176(1.0);5.2110(0.8);5.1968(1.8);5.1775(1.8);5.1628(0.8);4.7415(0.4);4.7258(0.5);4.7120(0.9);4.6976(0.9);4.6840(0.9);4.6565(3.0);4.6425(1.9);4.6234(1.6);4.6147(1.7);4.5979(2.4);4.5899(2.1);4.5582(1.4);4.5287(0.6);4.2661(3.1);4.2539(5.1);4.2399(3.1);4.0559(0.6);4.0390(1.8);4.0202(1.8);4.0026(0.6);3.3241(88.4);3.3241(88.4);3.0496(0.4);2.6708(0.7);2.5060(93.6);2.5017(121.8);2.4974(88.1);2.3287(0.7);2.2024(0.4);2.1879(1.0);2.1736(1.1);2.1537(1.3);2.1387(1.3);2.1252(0.5);2.0539(0.6);2.0402(1.2);2.0284(1.4);2.0149(0.9);2.0067(1.0);1.9888(8.4);1.3973(2.6);1.1928(2.1);1.1750(4.1);1.1572(2.0);0.0080(1.0);-0.0001(30.3)</p>

[1929]

649	3.76	<p>649: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.3085(1.9); 9.2880(2.0); 8.6476(8.2); 8.3888(1.4); 8.3732(1.6); 8.3651(1.6); 8.3496(1.5); 8.1547(0.5); 7.6899(2.7); 7.6851(5.2); 7.6803(2.9); 7.6387(1.6); 7.6155(3.1); 7.5923(1.6); 7.5128(1.7); 7.5088(1.6); 7.3687(2.0); 7.3408(2.1); 7.1945(0.9); 7.1910(1.0); 7.1736(2.0); 7.1559(1.2); 7.1525(1.2); 6.9340(1.5); 6.9157(2.4); 6.8992(1.2); 6.8968(1.2); 6.8099(2.7); 6.7897(2.5); 5.2926(0.5); 5.2790(1.2); 5.2593(1.2); 5.2449(0.6); 5.1397(1.0); 5.1247(2.2); 5.1092(1.0); 4.3009(0.4); 4.2935(0.4); 4.2812(1.1); 4.2719(1.1); 4.2537(1.6); 4.2400(1.0); 4.2326(1.2); 4.2124(0.4); 4.2051(0.3); 4.0377(0.8); 4.0200(0.8); 3.6455(0.8); 3.6328(2.3); 3.6195(2.3); 3.6063(1.2); 3.5285(2.3); 3.5160(3.1); 3.5041(1.1); 4.3.3211(12.7); 3.0487(16.0); 2.6747(0.4); 2.6700(0.6); 2.6660(0.4); 2.5234(1.3); 2.5097(37.4); 2.5056(78.3); 2.5011(104.9); 2.4967(76.0); 2.3324(0.4); 2.3278(0.6); 2.3234(0.5); 2.2371(0.4); 2.2287(0.5); 2.2165(0.8); 2.2074(0.6); 2.1953(0.8); 2.1839(0.6); 2.1748(0.4); 2.0742(9.8); 2.0583(0.7); 2.0518(0.7); 2.0411(0.6); 2.0328(0.6); 1.9885(3.7); 1.1924(1.0); 1.1746(1.9); 1.1568(0.9); 0.0079(0.6); -0.0003(20.1); -0.0085(0.8)</p>
650	4.51	<p>650: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1837(1.2); 9.1634(1.3); 8.6809(4.8); 8.2435(0.9); 8.2277(1.0); 8.2197(1.0); 8.2043(1.0); 7.6933(1.4); 7.6887(2.8); 7.6837(2.0); 7.6675(1.9); 7.6343(0.9); 7.5177(4.8); 7.5133(4.7); 7.3620(1.2); 7.3438(1.3); 7.1910(0.6); 7.1674(0.6); 7.1697(1.2); 7.1524(0.8); 7.1492(0.7); 6.93(4.0); 6.916(1.5); 6.8981(0.7); 6.8052(1.7); 6.7851(1.5); 5.7556(7.6); 5.2537(0.3); 5.2391(0.8); 5.2201(0.8); 5.2061(0.3); 4.2758(0.7); 4.2596(1.2); 4.2506(1.2); 4.2386(0.7); 4.2304(0.8); 3.5520(1.3); 3.5365(16.0); 3.5178(1.3); 3.3250(45.2); 3.0097(10.2); 2.7359(1.0); 2.7216(1.8); 2.7177(1.9); 2.7048(0.9); 2.7002(0.9); 2.5236(0.6); 2.5059(34.1); 2.5017(45.7); 2.4974(33.7); 2.2010(0.5); 2.1907(0.5); 2.1792(0.5); 2.1683(0.4); 2.0735(0.3); 2.0661(0.4); 2.0583(0.5); 2.0435(0.4); 2.0318(0.4); 2.0234(0.4); 0.0074(0.6); -0.0002(16.6); -0.0080(0.7)</p>
661	3.48	<p>661: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.2660(1.8); 9.2458(1.8); 8.7364(6.3); 8.4266(1.2); 8.4110(1.3); 8.4029(1.3); 8.3875(1.3); 7.7469(11.3); 7.7294(1.3); 7.7061(2.5); 7.6629(1.3); 7.3840(1.6); 7.3651(1.8); 7.1922(0.8); 7.1746(1.7); 7.1566(1.0); 7.1535(1.0); 6.9384(1.2); 6.9200(2.1); 6.9014(1.0); 6.8085(2.4); 6.7883(2.1); 5.2480(0.5); 5.2343(1.0); 5.2148(1.1); 5.2011(0.5); 4.2879(0.3); 4.2693(0.9); 4.2543(1.8); 4.2453(1.7); 4.2331(0.9); 4.2256(1.1); 4.2045(0.3); 3.7270(1.0); 3.7089(2.8); 3.6921(2.1); 3.6562(0.3); 3.6219(1.1); 3.6061(2.4); 3.5891(1.7); 3.5707(0.8); 3.3195(31.5); 3.0513(13.4); 2.9714(16.0); 2.6701(0.4); 2.5050(45.4); 2.5008(60.1); 2.4965(44.9); 2.3276(0.4); 2.2270(0.4); 2.2193(0.4); 2.2055(0.6); 2.1953(0.7); 2.1842(0.7); 2.1722(0.5); 2.0920(0.5); 2.0848(0.7); 2.0775(0.8); 2.0634(0.6); 2.0509(0.5); 0.0077(2.0); -0.0002(58.4); -0.0083(3.0)</p>
666	4.19	<p>666: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₆-DMSO): δ= 9.1888(0.4); 9.1756(2.0); 9.1551(2.1); 8.8415(0.9); 8.6572(7.6); 8.3810(1.4); 8.3654(1.5); 8.3574(1.6); 8.3419(1.4); 8.1800(1.9); 7.7145(0.7); 7.7106(0.7); 7.7059(0.4); 7.6898(2.4); 7.6854(4.3); 7.6909(2.5); 7.6365(1.6); 7.6133(3.0); 7.5902(1.5); 7.5413(1.0); 7.5373(0.9); 7.5138(7.7); 7.5099(7.4); 7.4093(1.7); 7.3948(1.9); 7.3893(1.9); 7.2887(1.0); 7.2836(1.3); 7.2686(2.6); 7.2587(1.1); 7.2540(1.1); 7.2404(2.9); 7.2351(3.5); 7.2262(3.2); 7.2177(2.7); 7.1992(0.5); 5.7554(1.1); 5.5865(0.6); 5.5671(1.7); 5.5474(1.8); 5.5277(0.6); 5.1663(0.3); 4.4586(0.6); 4.4451(0.3); 3.6266(3.1); 3.6152(2.4); 3.5424(2.7); 3.5304(3.5); 3.3506(1.4); 3.2177(0.4); 3.0483(16.0); 3.0232(0.8); 3.0095(0.7); 2.9699(0.8); 2.9917(1.0); 2.9833(1.0); 2.9700(1.0); 2.9614(0.9); 2.9068(0.8); 2.8863(1.6); 2.8662(1.3); 2.8468(0.9); 2.8263(0.5); 2.6707(0.3); 2.5694(0.4); 2.5600(0.5); 2.5497(0.8); 2.5390(1.1); 2.5290(1.2); 2.5059(41.4); 2.5017(53.0); 2.4974(39.4); 2.3925(2.1); 2.3288(0.3); 1.9889(1.1); 1.9703(1.1); 1.9596(0.6); 1.9500(1.1); 1.9391(1.1); 1.9293(0.5); 1.9188(0.9); 1.8974(0.3); 1.2324(0.6); 1.1749(0.4); -0.0001(16.4)</p>

[1930]

667	2.20	<p>667: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.1838(0.9); 9.1637(0.9); 8.6672(3.8); 8.2561(0.9); 8.2348(1.0); 8.2318(1.0); 7.8167(1.1); 7.8136(1.0); 7.7994(2.0); 7.7952(1.8); 7.7744(1.0); 7.7549(0.4); 7.7051(1.0); 7.6860(1.3); 7.6714(1.0); 7.6531(1.0); 7.6502(1.1); 7.6352(10.7); 7.5676(0.6); 7.5485(1.0); 7.5297(0.4); 5.7451(0.3); 5.7340(0.6); 5.7256(0.6); 5.7149(0.3); 3.6677(1.1); 3.3192(50.0); 3.2454(0.6); 3.2261(0.7); 3.1987(0.8); 3.1793(0.7); 3.0654(16.0); 2.6876(0.8); 2.6787(1.0); 2.6704(0.7); 2.6658(0.5); 2.6408(0.7); 2.6321(0.7); 2.5234(1.7); 2.5056(81.8); 2.5013(106.7); 2.4968(76.8); 2.3320(0.5); 2.3280(0.6); 2.3241(0.4); 1.9883(1.2); 1.3976(5.9); 1.1925(0.3); 1.1747(0.7); 1.1568(0.3); 0.1461(0.4); 0.0078(3.7); 0.0002(99.3); -0.0084(4.0); -0.1496(0.5)</p>
668	3.94	<p>668: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.1048(0.6); 9.0845(0.6); 8.5684(2.2); 8.2951(0.9); 8.2722(1.1); 7.7677(1.1); 7.7447(1.0); 7.6197(2.0); 7.3464(0.6); 7.3272(0.6); 7.1808(0.3); 7.1623(0.6); 7.1415(0.4); 6.9222(0.4); 6.9036(0.8); 6.8863(0.3); 6.7970(0.8); 6.7766(0.7); 5.2280(0.4); 5.2096(0.4); 4.2664(0.4); 4.2398(0.5); 4.2239(0.3); 4.2180(0.4); 3.3213(197.3); 3.0723(9.7); 3.0549(1.1); 2.6700(1.0); 2.5051(126.7); 2.5011(167.6); 2.4969(130.1); 2.3278(1.0); 1.3975(16.0); 0.1457(0.6); -0.0003(133.9); -0.1501(0.7)</p>
669	2.67	<p>669: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.0888(1.0); 9.0685(1.0); 8.5482(3.5); 8.2431(1.6); 8.2203(1.8); 7.7361(1.8); 7.7132(1.7); 7.3437(1.0); 7.3234(1.3); 7.2978(0.9); 7.2924(0.6); 7.2742(0.4); 7.1768(0.5); 7.1593(1.0); 7.1385(0.6); 7.0392(1.0); 7.0204(1.0); 6.9196(0.7); 6.9008(1.2); 6.8822(0.6); 6.7944(1.4); 6.7741(1.2); 5.2331(0.7); 5.2138(0.6); 4.2661(0.6); 4.2491(0.9); 4.2400(1.0); 4.2265(0.6); 4.2192(0.7); 3.3208(107.7); 3.0636(16.0); 2.6703(0.9); 2.5052(108.3); 2.5012(145.2); 2.4972(117.6); 2.3278(0.9); 2.1920(0.4); 2.1823(0.4); 2.1690(0.4); 2.0407(0.4); 2.0341(0.5); 2.0229(0.4); 2.0072(0.3); 1.3976(2.0); 0.1458(0.5); -0.0002(112.9); -0.1499(0.5)</p>
670	2.84	<p>670: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.0781(0.7); 9.0580(0.8); 8.5100(2.0); 8.1805(1.6); 8.1576(1.9); 7.6967(2.0); 7.6738(1.8); 7.3393(0.8); 7.3205(0.9); 7.2257(1.6); 7.1779(0.4); 7.1741(0.4); 7.1563(0.8); 7.1392(0.5); 7.1353(0.5); 7.0548(0.5); 7.0243(0.5); 6.9152(0.7); 6.8967(1.1); 6.8779(0.6); 6.8666(0.5); 6.8407(0.5); 6.7933(1.2); 6.7749(1.1); 5.7551(0.4); 5.2322(0.5); 5.2138(0.5); 4.2667(0.5); 4.2575(0.5); 4.2498(0.6); 4.2380(0.7); 4.2252(0.4); 4.2173(0.6); 3.5677(5.0); 3.3190(47.9); 3.0537(16.0); 2.6747(0.4); 2.6701(0.6); 2.6656(0.4); 2.5235(1.3); 2.5099(32.8); 2.5056(69.2); 2.5011(93.6); 2.4966(68.7); 2.4922(34.2); 2.3633(0.6); 2.3451(2.6); 2.3280(0.8); 2.3235(0.6); 2.1902(0.4); 2.1802(0.3); 2.1680(0.3); 2.0341(0.4); 1.3975(0.9); 1.3203(1.7); 1.2826(8.0); 0.8894(0.7); 0.1460(0.4); 0.0079(3.1); -0.0002(94.5); -0.0084(4.2); -0.1497(0.4)</p>
671	3.00	<p>671: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.0854(0.5); 9.0650(0.5); 8.6944(0.6); 8.5236(3.9); 8.2521(1.7); 8.2292(1.8); 7.7966(0.6); 7.7790(1.0); 7.7534(1.9); 7.7395(0.5); 7.7304(2.0); 7.7225(1.0); 7.7009(0.6); 7.6084(0.8); 7.3380(0.8); 7.3199(0.9); 7.1766(0.5); 7.1728(0.4); 7.1553(0.9); 7.1381(0.5); 7.1340(0.5); 6.9150(0.6); 6.8944(1.0); 6.8759(0.5); 6.7934(1.3); 6.7728(1.1); 5.7556(0.5); 5.2278(0.6); 5.2078(0.6); 4.2631(0.6); 4.2545(0.6); 4.2459(0.7); 4.2376(0.8); 4.2136(0.5); 3.3202(122.1); 3.0699(16.0); 3.0549(2.9); 2.6746(0.7); 2.6700(0.9); 2.6656(0.7); 2.5233(2.3); 2.5098(55.6); 2.5055(115.1); 2.5011(154.0); 2.4966(112.5); 2.4923(56.1); 2.3322(0.6); 2.3278(0.9); 2.3234(0.7); 2.1869(0.4); 2.1780(0.4); 2.1659(0.4); 2.0309(0.4); 0.8892(0.7); 0.1457(0.7); 0.0077(4.8); -0.0002(143.2); -0.0084(6.6); -0.1498(0.7)</p>
672	2.20	<p>672: ¹H-NMR(400.0 MHz, d₂-DMSO): δ = 9.0722(0.4); 9.0608(0.9); 9.0405(0.9); 8.5074(3.8); 8.1786(1.6); 8.1557(1.9); 7.6922(1.9); 7.6693(1.8); 7.3389(0.8); 7.3198(0.9); 7.1783(0.4); 7.1747(0.4); 7.1572(0.8); 7.1400(0.5); 7.0250(1.5); 6.9161(0.6); 6.8975(1.1); 6.8814(0.5); 6.8787(0.5); 6.8394(1.0); 6.8085(1.0); 6.7953(1.3); 6.7748(1.1); 6.3561(0.3); 5.2342(0.5); 5.2146(0.5); 4.2667(0.5); 4.2498(0.7); 4.2396(0.8); 4.2261(0.5); 4.2188(0.6); 3.3229(33.8); 3.0542(16.0); 2.5234(0.5); 2.5097(11.7); 2.5056(24.2); 2.5011(32.4); 2.4966(23.8); 2.4923(11.9); 2.3130(4.7); 2.3061(4.8); 2.1910(0.3); 2.1813(0.4); 2.1686(0.4); 2.1573(1.8); 2.0410(0.3); 2.0334(0.4); 1.2344(0.4); 0.0079(1.1); -0.0002(31.5); -0.0084(1.4)</p>

[1931]

673	2.73		673: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₂ -DMSO): δ = 9.0829(2.0), 9.0626(2.0), 8.4835(6.9), 8.4575(1.2), 8.4426(1.3), 8.4336(1.3), 8.4188(1.2), 7.8687(0.8), 7.8560(1.6), 7.8426(0.8), 7.6931(16.0), 7.5995(1.6), 7.5762(3.1), 7.5529(2.2), 7.5258(0.6), 7.5058(0.5), 7.4860(0.4), 7.4803(0.5), 7.4548(3.8), 7.4504(3.9), 7.2728(1.8), 7.2546(1.9), 7.1790(0.9), 7.1752(0.9), 7.1581(1.8), 7.1405(1.2), 7.1365(1.1), 6.9004(1.4), 6.8818(2.3), 6.8654(1.0), 6.8631(1.1), 6.7942(2.6), 6.7756(2.3), 6.2176(2.4), 6.2126(4.3), 6.2077(2.5), 5.7555(10.1), 5.2284(0.5), 5.2199(1.2), 5.1949(1.2), 5.1806(0.5), 4.4965(0.6), 4.4922(0.6), 4.4773(1.9), 4.4617(4.2), 4.4463(2.1), 4.2421(1.9), 4.2296(3.2), 4.2156(2.5), 3.8610(1.0), 3.8460(2.6), 3.8316(2.5), 3.8166(0.9), 3.3249(29.4), 2.6705(0.3), 2.5239(0.8), 2.5189(1.2), 2.5103(18.1), 2.5061(37.6), 2.5017(50.5), 2.4972(37.0), 2.4929(18.4), 2.1465(0.6), 2.1327(0.6), 2.1260(0.6), 2.1119(0.9), 2.0972(0.9), 2.0828(0.3), 2.0328(0.4), 2.0199(0.8), 2.0077(0.9), 1.9943(0.6), 1.9858(0.6), 1.9715(0.5), 1.3520(0.8), 1.2586(0.4), 1.2276(0.9), 0.0072(2.0), -0.0002(60.9), -0.0084(2.8)
674	4.13		674: ¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₂ -DMSO): δ = 9.2997(1.7), 9.2792(1.7), 8.6010(6.9), 8.3134(2.8), 8.2904(3.1), 7.7458(3.3), 7.7229(3.2), 7.6789(2.2), 7.6743(4.1), 7.6696(2.4), 7.6590(0.4), 7.6355(0.7), 7.5524(0.4), 7.3767(1.8), 7.3464(1.8), 7.3278(1.8), 7.1892(0.9), 7.1856(0.9), 7.1683(1.7), 7.1509(1.1), 7.1473(1.0), 6.9239(1.2), 6.9054(2.1), 6.8889(1.0), 6.8866(1.0), 6.8042(2.4), 6.7835(2.0), 5.7555(1.3), 5.2834(0.5), 5.2687(1.0), 5.2494(1.1), 5.2346(0.6), 5.1224(1.1), 5.1071(2.5), 5.0920(1.1), 4.2941(0.5), 4.2867(0.5), 4.2744(1.1), 4.2654(1.0), 4.2580(1.2), 4.2502(1.4), 4.2432(1.2), 4.2303(0.9), 4.2227(1.1), 4.2024(0.4), 1.950(0.3), 3.7342(0.3), 3.7229(0.4), 3.7106(0.4), 3.6435(0.8), 3.6309(2.1), 3.6172(2.4), 3.6039(1.3), 3.5678(16.0), 3.5277(2.0), 3.5149(2.7), 3.5038(1.3), 3.3194(58.5), 3.0752(0.5), 3.0653(1.3), 3.0459(13.7), 2.6748(0.7), 2.6702(1.0), 2.6658(0.7), 2.5097(63.1), 2.5057(123.7), 2.5013(161.6), 2.4968(118.2), 2.3325(0.7), 2.3281(0.9), 2.3237(0.7), 2.2229(0.5), 2.2097(0.7), 2.2002(0.7), 2.1882(0.8), 2.1771(0.6), 2.1664(0.4), 2.0605(0.7), 2.0529(0.8), 2.0428(0.6), 2.0365(0.6), 2.0287(0.6), 2.0185(0.6), 1.2586(0.5), 1.2492(0.6), 1.2355(1.6), 0.1461(0.6), 0.0077(5.9), 0.0000(131.3), -0.0081(7.0), -0.1495(0.6)
377		LC-MS (方法 L2): R _t = 2.83 min; m/z = 473 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.97 (s, 1H), 8.22 (m, 1H), 8.09 (d, J = 1.1 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 7.60 (m, 1H), 7.29 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.26 - 7.16 (m, 2H), 6.96 - 6.81 (m, 3H), 5.41 - 5.33 (m, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.13 (s, 6H), 2.44 - 2.33 (m, 1H), 2.25 - 2.15 (m, 1H).
378		LC-MS (方法 L2): R _t = 2.82 min; m/z = 450 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.91 (s, 1H), 8.77 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.25 (m, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.79 (m, 1H), 7.72 (m, 1H), 7.67 - 7.59 (m, 1H), 7.31 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.24 - 7.17 (m, 1H), 7.13 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.98 - 6.90 (m, 1H), 6.87 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.37 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.35 (m, 1H), 4.21 (m, 1H), 3.15 (s, 6H), 2.46 - 2.34 (m, 1H), 2.22 (m, 1H).
379		LC-MS (方法 L2): R _t = 2.08 min; m/z = 440 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 9.01 (s, 1H), 8.15 (t, J = 6.3 Hz, 2H), 7.68 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 7.62 - 7.54 (m, 1H), 7.41 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.21 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.90 (m, 3H), 6.76 (s, 1H), 5.38 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.48 (s, 2H), 4.35 (m, 1H), 4.25 - 4.16 (m, 1H), 3.12 (s, 6H), 2.39 (m, 1H), 2.21 (m, 1H).
380		LC-MS (方法 L2): R _t = 2.24 min; m/z = 439 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 9.00 (s, 1H), 8.58 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.18 (m, 1H), 7.69 (m, 1H), 7.59 (m, 1H), 7.43 - 7.28 (m, 4H), 7.24 - 7.17 (m, 1H), 6.97 - 6.83 (m, 2H), 5.38 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.35 (m, 1H), 4.20 (m, 1H), 3.13 (s, 6H), 2.63 (s, 3H), 2.45 - 2.34 (m, 1H), 2.22 (m, 1H).
381		LC-MS (方法 L2): R _t = 2.26 min; m/z = 439 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.92 (s, 1H), 8.52 - 8.43 (m, 2H), 8.20 (m, 1H), 7.63 - 7.56 (m, 1H), 7.52 (m, 1H), 7.31 (m, 2H), 7.23 - 7.17 (m, 1H), 7.14 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 6.96 - 6.82 (m, 2H), 5.37 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.15 (s, 6H), 2.38 (m, 1H), 2.26 - 2.15 (m, 1H), 2.01 (s, 3H).
382		LC-MS (方法 L2): R _t = 2.63 min; m/z = 259 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.91 (s, 1H), 8.70 (s, 1H), 8.55 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 8.28 - 8.20 (m, 1H), 7.65 - 7.57 (m, 2H), 7.35 - 7.27 (m, 2H), 7.24 - 7.14 (m, 2H), 6.92 (m, 1H), 6.86 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.41 - 5.33 (m, 1H), 4.39 - 4.29 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.15 (s, 6H), 2.44 - 2.33 (m, 1H), 2.20 (m, 1H).

[1932]

383	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.59 min; m/z = 443 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.94 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.49 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 8.23 (m, 1H), 7.70 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.61 (m, 1H), 7.45 - 7.38 (m, 1H), 7.29 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 7.23 - 7.16 (m, 1H), 6.92 (m, 1H), 6.86 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.41 - 5.32 (m, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.14 (s, 6H), 2.44 - 2.33 (m, 1H), 2.21 (m, 1H).
387	LC-MS (方法 M14): Rt = 1.40 min; m/z = 469 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 2.05-2.10 (m, 1H), 2.19-2.24 (m, 1H), 2.44 (s, 3H), 3.09 (s, 6H), 4.23-4.30 (m, 2H), 5.26 (q, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.66 (t, 1H), 7.99 (s, 1H), 8.20 (d, 1H), 8.46 (d, 1H), 8.73 (s, 1H), 9.17 (d, 1H).
388	LC-MS (方法 M24): Rt = 1.27 min; m/z = 458 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 2.04-2.08 (m, 1H), 2.16-2.23 (m, 4H), 2.41 (s, 3H), 3.05 (s, 6H), 4.22-4.30 (m, 2H), 5.26 (q, 1H), 6.72 (s, 1H), 6.80 (s, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.17 (t, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.58-7.62 (m, 2H), 7.13-7.17 (m, 1H), 8.56 (s, 1H), 9.09 (d, 1H).
389	LC-MS (方法 M23): Rt = 1.65 min; m/z = 455 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 2.06-2.09 (m, 1H), 2.20-2.22 (m, 1H), 3.10 (s, 6H), 4.25-4.29 (m, 2H), 5.26 (q, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.96 (t, 1H), 7.18 (t, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.67 (t, 1H), 7.97 (d, 1H), 8.11 (d, 1H), 8.21 (d, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.75 (s, 1H), 9.18 (d, 1H).
390	LC-MS (方法 M23): Rt = 1.67 min; m/z = 464 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 2.08-2.09 (m, 1H), 2.20-2.23 (m, 1H), 3.07 (s, 6H), 4.25-4.30 (m, 2H), 5.26 (q, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.16-7.21 (m, 2H), 7.40 (d, 1H), 7.61 (t, 1H), 7.81 (d, 1H), 8.10 (d, 1H), 8.33 (d, 1H), 8.70 (s, 1H), 9.15 (d, 1H).
391	LC-MS (方法 M14): Rt = 1.01 min; m/z = 444 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 2.05-2.10 (m, 1H), 2.18-2.24 (m, 1H), 2.49 (s, 3H), 3.05 (s, 6H), 4.25-4.30 (m, 2H), 5.27 (q, 1H), 6.80-6.85 (m, 2H), 6.95 (t, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.66 (d, 1H), 8.05 (d, 1H), 8.15 (d, 1H), 8.67 (s, 1H), 9.14 (d, 1H).
399	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.31 min; m/z = 510 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 9.02 (s, 1H), 8.29 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.16 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.70 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.63 - 7.54 (m, 1H), 7.33 (m, 2H), 7.21 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.91 (m, 4H), 5.38 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.40 - 4.31 (m, 1H), 4.26 - 4.16 (m, 1H), 3.88 - 3.79 (m, 4H), 3.59 - 3.51 (m, 4H), 3.13 (s, 6H), 2.40 (m, 1H), 2.27 - 2.17 (m, 1H).
400	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.86 min; m/z = 489 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.95 (s, 1H), 8.27 - 8.18 (m, 2H), 7.58 (q, J = 4.5 Hz, 2H), 7.29 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.20 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 6.92 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 6.78 (s, 1H), 5.37 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.33 (m, 1H), 4.24 - 4.13 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.14 (s, 6H), 2.44 - 2.33 (m, 1H), 2.25 - 2.14 (m, 1H).
401	LC-MS (方法 L9): Rt = 3.59 min; m/z = 455 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.96 (s, 1H), 8.41 - 8.25 (m, 2H), 8.18 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.59 (m, 3H), 7.30 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.21 (m, 2H), 6.97 - 6.83 (m, 2H), 5.37 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.25 - 4.16 (m, 1H), 3.77 (s, 3H), 3.13 (s, 6H), 2.39 (m, 1H), 2.26 - 2.15 (m, 1H).
402	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.25 min; m/z = 455 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.96 (s, 1H), 8.63 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.19 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 7.0 Hz, 1H), 7.60 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.47 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 7.5 Hz, 2H), 7.21 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.42 - 5.33 (m, 1H), 4.63 (s, 2H), 4.39 - 4.30 (m, 1H), 4.25 - 4.15 (m, 1H), 3.14 (s, 6H), 2.39 (m, 1H), 2.26 - 2.16 (m, 1H), 1.68 (s, 1H).
403	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.89 min; m/z = 461 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.91 (s, 1H), 8.46 (s, 2H), 8.28 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.71 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.68 - 7.60 (m, 1H), 7.29 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.24 - 7.12 (m, 2H), 6.92 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.37 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.24 - 4.14 (m, 1H), 3.15 (s, 6H), 2.38 (m, 1H), 2.21 (m, 1H).
413	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.02 min; m/z = 461 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.94 (s, 1H), 8.24 (m, 1H), 7.72 (m, 1H), 7.65 - 7.57 (m, 1H), 7.30 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.25 - 7.17 (m, 1H), 7.12 (s, 3H), 6.94 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.38 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.35 (m, 1H), 4.21 (m, 1H), 3.15 (s, 6H), 2.45 - 2.34 (m, 1H), 2.22 (m, 1H).
414	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.97 min; m/z = 477 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.91 (s, 1H), 8.32 - 8.22 (m, 2H), 7.70 (d, J = 6.9 Hz, 1H), 7.66 - 7.58 (m, 1H), 7.36 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.25 - 7.17 (m, 1H), 7.12 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.37 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.35 (m, 1H), 4.20 (m, 1H), 3.15 (s, 6H), 2.39 (m, 1H), 2.21 (m, 1H).

[1933]

415	LC-MS (方法 L2): R _t = 3.02 min; m/z = 493 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.88 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.25 (m, 1H), 7.65 - 7.56 (m, 2H), 7.36 (s, 1H), 7.29 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.24 - 7.17 (m, 1H), 7.09 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.86 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.37 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.16 (s, 6H), 2.39 (m, 1H), 2.20 (m, 1H).
416	LC-MS (方法 L2): R _t = 3.14 min; m/z = 501 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.98 (s, 1H), 8.21 (m, 1H), 8.09 - 8.03 (m, 1H), 7.67 (d, J = 6.3 Hz, 1H), 7.63 - 7.55 (m, 1H), 7.30 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.25 - 7.16 (m, 2H), 6.96 - 6.83 (m, 2H), 6.76 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 5.37 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 5.27 (m, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.13 (s, 6H), 2.38 (m, 1H), 2.20 (m, 1H), 1.37 (d, J = 6.2 Hz, 6H).
429	LC-MS (方法 L2): R _t = 3.017 min; m/z = 508/510/512 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 10.23 (s, 1H), 9.07 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.69 - 7.55 (m, 3H), 7.49 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.24 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.29 - 4.15 (m, 2H), 2.99 (s, 6H), 2.29 - 2.12 (m, 1H), 2.10 - 1.95 (m, 1H).
433	LC-MS (方法 L2): R _t = 3.189 min; m/z = 560 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.50 (d, J = 0.8 Hz, 1H), 8.29 - 8.21 (m, 1H), 7.95 - 7.87 (m, 1H), 7.66 - 7.58 (m, 2H), 7.52 - 7.43 (m, 1H), 7.33 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.27 - 7.19 (m, 1H), 7.15 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 6.90 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.27 - 5.17 (m, 1H), 4.32 - 4.16 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.24 - 2.12 (m, 1H), 2.08 - 1.96 (m, 1H).
434	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.894 min; m/z = 510 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.10 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.50 (d, J = 0.8 Hz, 1H), 8.29 - 8.21 (m, 1H), 7.95 - 7.87 (m, 1H), 7.66 - 7.58 (m, 2H), 7.52 - 7.43 (m, 1H), 7.33 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.27 - 7.19 (m, 1H), 7.15 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 6.90 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.27 - 5.17 (m, 1H), 4.32 - 4.16 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.24 - 2.12 (m, 1H), 2.08 - 1.96 (m, 1H).
435	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.808 min; m/z = 483/485 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.32 - 8.23 (m, 1H), 7.96 - 7.84 (m, 2H), 7.80 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.71 - 7.62 (m, 2H), 7.34 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.16 (t, 1H), 6.91 (t, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.29 - 5.17 (m, 1H), 4.33 - 4.17 (m, 2H), 3.08 (s, 6H), 2.25 - 2.13 (m, 1H), 2.10 - 1.95 (m, 1H).
436	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.711 min; m/z = 456 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.22 (dd, J = 8.4, 1.4 Hz, 1H), 7.66 - 7.60 (m, 1H), 7.59 - 7.53 (m, 1H), 7.37 - 7.26 (m, 2H), 7.20 - 7.07 (m, 2H), 6.97 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.5, 1.0 Hz, 1H), 6.79 (d, 1H), 5.28 - 5.19 (m, 1H), 4.32 - 4.18 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.25 - 2.13 (m, 1H), 2.11 - 1.97 (m, 1H), 1.90 (s, 3H).
437	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.763 min; m/z = 456 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.08 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.22 (dd, J = 8.0, 2.0 Hz, 1H), 7.69 - 7.59 (m, 2H), 7.35 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.28 - 7.07 (m, 4H), 6.91 (t, J = 7.5, 1.1 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2, 0.9 Hz, 1H), 5.29 - 5.20 (m, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.34 (s, 3H), 2.26 - 2.13 (m, 1H), 2.11 - 1.99 (m, 1H).
441	LC-MS (方法 M22): R _t = 1.67 min; m/z = 540 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 2.03-2.09 (m, 1H), 2.20-2.25 (m, 1H), 3.27-3.29 (m, 4H), 3.66-3.88 (m, 4H), 4.21-4.29 (m, 2H), 5.26 (q, 1H), 6.80 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.18 (t, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.70 (t, 1H), 7.79 (d, 1H), 8.28 (d, 1H), 8.67 (s, 1H), 9.19 (d, 1H).
442	LC-MS (方法 M22): R _t = 1.46 min; m/z = 506 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 2.07-2.08 (m, 1H), 2.21-2.23 (m, 1H), 3.29-3.31 (m, 4H), 3.67-3.88 (m, 4H), 4.22-4.31 (m, 2H), 5.27 (q, 1H), 6.80 (d, 1H), 6.93 (t, 1H), 7.17-7.20 (m, 2H), 7.39 (d, 1H), 7.71 (t, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.92 (d, 1H), 8.30 (d, 1H), 8.67 (s, 1H), 9.21 (d, 1H).
443	LC-MS (方法 M22): R _t = 1.84 min; m/z = 506 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 2.07-2.12 (m, 1H), 2.21-2.26 (m, 1H), 3.28-3.30 (m, 4H), 3.67-3.90 (m, 4H), 4.23-4.31 (m, 2H), 5.28 (q, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.96 (t, 1H), 7.17-7.21 (m, 2H), 7.42 (d, 1H), 7.67 (t, 1H), 7.83 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.37 (d, 1H), 8.77 (s, 1H), 9.24 (d, 1H).
456	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.76 min; m/z = 445 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.14 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.67 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.28 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 7.65 - 7.57 (m, 1H), 7.39 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.22 - 7.15 (m, 1H), 6.95 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.30 - 5.22 (m, 1H), 4.34 - 4.21 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.68 (s, 3H), 2.27 - 2.16 (m, 1H), 2.12 - 2.01 (m, 1H).
457	LC-MS (方法 L2): R _t = 3.33 min; m/z = 464 (M+H) ⁺ 采用CI模式。	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 9.05 (s, 1H), 8.03 (m, 2H), 7.58 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.53 (m, 1H), 7.39 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.26 - 7.17 (m, 2H), 6.95 (m, 1H), 6.88 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 5.38 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.41 - 4.31 (m, 1H), 4.22 (m, 1H), 3.11 (s, 6H), 2.45 - 2.34 (m, 1H), 2.23 (m, 1H).

[1934]

458	LC-MS (方法 L2): $R_t = 3.82$ min; $m/z = 498$ (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 9.02 (s, 1H), 8.14 - 8.04 (m, 2H), 7.66 - 7.59 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 7.48 - 7.41 (m, 1H), 7.32 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.26 - 7.17 (m, 2H), 6.95 (m, 1H), 6.91 - 6.84 (m, 1H), 5.42 - 5.33 (m, 1H), 4.41 - 4.32 (m, 1H), 4.22 (m, 1H), 3.12 (s, 6H), 2.46 - 2.34 (m, 1H), 2.28 - 2.16 (m, 1H); 包含 2.6% (w/w) EtOAc 和 0.2% (w/w) DIP.
459	LC-MS (方法 L2): $R_t = 3.26$ min; $m/z = 448$ (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 9.04 (s, 1H), 8.00 (m, 2H), 7.56 - 7.49 (m, 1H), 7.46 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.36 - 7.29 (m, 2H), 7.25 - 7.17 (m, 1H), 6.95 (m, 1H), 6.88 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 6.52 (m, 1H), 5.38 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.41 - 4.31 (m, 1H), 4.22 (m, 1H), 3.10 (s, 6H), 2.45 - 2.34 (m, 1H), 2.28 - 2.17 (m, 1H).
460	LC-MS (方法 L2): $R_t = 2.96$ min; $m/z = 493$ (M+H) ⁺ 采用 2°C 模式。	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.86 (s, 1H), 8.65 - 8.59 (m, 2H), 8.27 (m, 1H), 7.64 (m, 1H), 7.55 (m, 1H), 7.28 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.24 - 7.17 (m, 1H), 7.06 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 6.92 (m, 1H), 6.86 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 5.37 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.38 - 4.30 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.17 (s, 6H), 2.44 - 2.33 (m, 1H), 2.20 (m, 1H).
461	LC-MS (方法 L2): $R_t = 3.774$ min; $m/z = 602$ (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (t, 1H), 8.57 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.35 - 8.28 (m, 1H), 8.15 - 8.08 (m, 1H), 8.06 - 8.00 (m, 1H), 7.74 - 7.65 (m, 3H), 7.35 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 6.90 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.27 - 5.19 (m, 1H), 4.31 - 4.17 (m, 2H), 3.94 - 3.85 (m, 4H), 3.37 - 3.22 (m, 4H); 与水信号重叠。); 2.26 - 2.15 (m, 1H), 2.09 - 1.97 (m, 1H).
462	LC-MS (方法 L2): $R_t = 3.556$ min; $m/z = 534/536/538$ (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.18 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.33 - 8.25 (m, 1H), 7.73 - 7.66 (m, 2H), 7.62 - 7.56 (m, 1H), 7.52 (dd, J = 8.6, 2.5 Hz, 1H), 7.44 (bs, 1H), 7.37 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.16 (t, 1H), 6.92 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.29 - 5.20 (m, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.94 - 3.81 (m, 4H), 3.36 - 3.22 (m, 4H); 与水信号重叠。); 2.27 - 2.15 (m, 1H), 2.11 - 1.99 (m, 1H).
463	LC-MS (方法 L2): $R_t = 3.464$ min; $m/z = 552$ (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.57 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.29 (dd, J = 7.8, 2.1 Hz, 1H), 7.92 (dt, J = 9.2, 4.9 Hz, 1H), 7.71 - 7.62 (m, 2H), 7.49 (td, J = 8.5, 2.3 Hz, 1H), 7.35 (dd, J = 7.1, 2.8 Hz, 1H), 7.24 (ddd, J = 17.1, 9.3, 2.5 Hz, 1H), 7.18 - 7.11 (m, 1H), 6.91 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.28 - 5.20 (m, 1H), 4.32 - 4.18 (m, 2H), 3.94 - 3.82 (m, 4H), 3.37 - 3.21 (m, 4H); 与水信号重叠。); 2.28 - 2.15 (m, 1H), 2.09 - 1.98 (m, 1H).
464	LC-MS (方法 L2): $R_t = 3.359$ min; $m/z = 525/527$ (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.18 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.35 - 8.28 (m, 1H), 7.93 (dd, J = 8.3, 2.0 Hz, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.80 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.72 (d, J = 5.1 Hz, 2H), 7.36 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.16 (t, 1H), 6.91 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.25 (q, J = 5.8 Hz, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.94 - 3.85 (m, 4H), 3.37 - 3.22 (m, 4H); 与水信号重叠。); 2.27 - 2.16 (m, 1H), 2.10 - 1.99 (m, 1H).
465	LC-MS (方法 L2): $R_t = 3.263$ min; $m/z = 514/516$ (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.26 (dd, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.72 - 7.64 (m, 1H), 7.64 - 7.59 (m, 1H), 7.41 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.24 (dd, J = 8.3, 1.8 Hz, 1H), 7.21 - 7.11 (m, 2H), 6.91 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.30 - 5.21 (m, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.93 - 3.80 (m, 4H), 3.36 - 3.21 (m, 4H); 与水信号重叠。); 2.33 (s, 3H), 2.27 - 2.15 (m, 1H), 2.10 - 1.99 (m, 1H).
466	LC-MS (方法 L2): $R_t = 3.112$ min; $m/z = 498$ (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.16 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.26 (dd, J = 8.4, 1.3 Hz, 1H), 7.72 - 7.64 (m, 1H), 7.64 - 7.57 (m, 1H), 7.36 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.31 (dd, J = 8.3, 6.2 Hz, 1H), 7.20 - 7.09 (m, 2H), 6.97 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 6.91 (t, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.29 - 5.21 (m, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.93 - 3.82 (m, 4H), 3.36 - 3.22 (m, 4H); 与水信号重叠。); 2.27 - 2.16 (m, 1H), 2.10 - 2.00 (m, 1H), 1.89 (s, 3H).
467	LC-MS (方法 L2): $R_t = 3.239$ min; $m/z = 498$ (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.27 (dd, J = 7.4, 2.6 Hz, 1H), 7.74 - 7.65 (m, 2H), 7.37 (d, J = 7.1 Hz, 1H), 7.28 - 7.22 (m, 1H), 7.22 - 7.10 (m, 3H), 6.92 (t, J = 7.5, 1.0 Hz, 1H), 6.80 (d, 1H), 6.80 (d, 1H), 5.30 - 5.22 (m, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.93 - 3.84 (m, 4H), 3.36 - 3.22 (m, 6H); 与水信号重叠。); 2.34 (s, 3H), 2.27 - 2.16 (m, 1H), 2.11 - 2.01 (m, 1H).

[1935]

468	LC-MS (方法 L2): R _t = 3.043 min; m/z = 494 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.15 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.56 (s, 1H), 8.23 (dd, J = 8.5, 1.2 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 8.3, 7.1 Hz, 1H), 7.56 (dd, J = 7.0, 1.2 Hz, 1H), 7.36 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.21 - 7.12 (m, 2H), 7.12 - 7.05 (m, 1H), 6.98 - 6.87 (m, 2H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.31 - 5.20 (m, 1H), 4.34 - 4.18 (m, 2H), 3.87 (s, 4H), 3.36 - 3.22 (m, 4H); 与水信号重叠), 2.29 (s, 3H), 2.26 - 2.15 (m, 1H), 2.11 - 1.99 (m, 1H), 1.87 (d, J = 6.7 Hz, 3H).
469	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.944 min; m/z = 492/494/496 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.09 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.30 - 8.20 (m, 1H), 7.65 (d, J = 5.1 Hz, 2H), 7.59 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 8.6, 2.6 Hz, 1H), 7.43 (bs, 1H), 7.34 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.17 (t, 1H), 6.91 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.27 - 5.19 (m, 1H), 4.32 - 4.18 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.26 - 2.13 (m, 1H), 2.10 - 1.96 (m, 1H).
470	LC-MS (方法 L9): R _t = 2.815 min; m/z = 472/474 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.09 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.51 (s, 1H), 8.22 (dd, J = 8.3, 1.4 Hz, 1H), 7.67 - 7.55 (m, 2H), 7.40 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 8.2, 1.8 Hz, 1H), 7.20 - 7.10 (m, 2H), 6.91 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.28 - 5.19 (m, 1H), 4.32 - 4.19 (m, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.25 - 2.14 (m, 1H), 2.09 - 1.97 (m, 1H).
471	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.770 min; m/z = 452 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.07 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.19 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.61 (t, 1H), 7.52 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 7.34 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.21 - 7.12 (m, 2H), 7.09 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 6.98 - 6.86 (m, 2H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.29 - 5.18 (m, 1H), 4.32 - 4.17 (m, 2H), 3.06 (s, 6H), 2.29 (s, 3H), 2.25 - 2.13 (m, 1H), 2.09 - 1.97 (m, 1H), 1.88 (d, J = 7.0 Hz, 3H).
472	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.75 min; m/z = 485 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 9.03 (s, 1H), 8.15 (m, 1H), 7.68 (m, 1H), 7.57 (m, 1H), 7.38 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.24 - 7.17 (m, 1H), 6.93 (m, 1H), 6.87 (m, 1H), 6.55 (s, 2H), 5.38 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.35 (m, 1H), 4.20 (m, 1H), 3.96 (s, 6H), 3.12 (s, 6H), 2.45 - 2.34 (m, 1H), 2.21 (m, 1H).
473	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.76 min; m/z = 473 (M+H) ⁺ . 采用 CI 模式。	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.97 (s, 1H), 8.20 (m, 1H), 7.68 (m, 1H), 7.59 (m, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.34 (s, 1H), 7.31 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.24 - 7.16 (m, 2H), 6.94 (m, 1H), 6.90 - 6.84 (m, 1H), 5.38 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.40 - 4.31 (m, 1H), 4.21 (m, 1H), 3.14 (s, 6H), 2.61 (s, 3H), 2.46 - 2.34 (m, 1H), 2.22 (m, 1H).
474	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.54 min; m/z = 465 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 9.00 (s, 1H), 8.17 (m, 1H), 7.96 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 7.65 (m, 1H), 7.58 (m, 1H), 7.42 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.24 - 7.16 (m, 1H), 6.92 (m, 1H), 6.89 - 6.83 (m, 2H), 5.37 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 4.06 (s, 3H), 3.57 (s, 3H), 3.13 (s, 6H), 2.45 - 2.33 (m, 1H), 2.21 (m, 1H).
475	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.76 min; m/z = 489 (M+H) ⁺ . 采用 CI 模式。	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.94 (s, 1H), 8.25 - 8.18 (m, 1H), 8.13 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 7.64 - 7.56 (m, 2H), 7.28 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.26 - 7.15 (m, 2H), 6.95 - 6.89 (m, 2H), 6.86 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.37 (q, J = 5.4 Hz, 1H), 4.34 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 4.08 (s, 3H), 3.14 (s, 6H), 2.44 - 2.32 (m, 1H), 2.20 (m, 1H).
476	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.91 min; m/z = 493 (M+H) ⁺ . 采用 2 ⁺ CI 模式。	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.88 (s, 1H), 8.36 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 8.25 (m, 1H), 7.65 - 7.56 (m, 2H), 7.29 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.25 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 7.23 - 7.16 (m, 1H), 7.10 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 6.92 (m, 1H), 6.89 - 6.83 (m, 1H), 5.37 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.38 - 4.30 (m, 1H), 4.19 (m, 1H), 3.16 (s, 6H), 2.44 - 2.33 (m, 1H), 2.20 (m, 1H).
480	LC-MS (方法 M22): R _t = 1.26 min; m/z = 500 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 2.05-2.06 (m, 1H), 2.16 (s, 3H), 2.19-2.21 (m, 1H), 2.42 (s, 3H), 3.26-3.30 (m, 4H), 3.85-3.88 (m, 4H), 4.24-4.28 (m, 2H), 5.25 (q, 1H), 6.72 (d, 1H), 6.80 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.18 (t, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.62-7.65 (m, 2H), 8.20 (d, 1H), 8.63 (s, 1H), 9.16 (d, 1H).
491	LC-MS (方法 L2): R _t = 3.75 min; m/z = 536 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.82 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.29 (m, 1H), 7.56 (m, 1H), 7.44 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 7.34 (m, 2H), 7.28 (s, 2H), 7.24 (m, 2H), 6.50 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 5.72 (m, 1H), 3.94 (t, J = 3.9 Hz, 4H), 3.43 (m, 4H), 3.10 - 2.90 (m, 2H), 2.74 (m, 1H), 1.96 (m, 1H).
492	LC-MS (方法 L2): R _t = 3.87 min; m/z = 550 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿 -d) δ 8.83 (d, J = 1.1 Hz, 1H), 8.29 (m, 1H), 7.56 (m, 1H), 7.44 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 7.33 (m, 2H), 7.25 - 7.08 (m, 4H), 6.65 - 6.54 (m, 1H), 5.45 - 5.36 (m, 1H), 4.12 (q, J = 7.2 Hz, 0H), 3.92 (m, 4H), 3.43 (m, 4H), 2.89 - 2.74 (m, 2H), 2.24 - 2.11 (m, 1H), 2.09 - 1.98 (m, 1H), 1.97 - 1.77 (m, 2H).

[1936]

496	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.93 min, m/z = 564/566 (M+H) ⁺ CI2 模式	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d) δ 8.90 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 7.55 - 7.47 (m, 2H), 7.36 (dd, J = 21.1, 7.6 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 9.6 Hz, 2H), 7.24 - 7.18 (m, 2H), 6.99 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 5.39 (q, J = 5.5 Hz, 1H), 4.39 - 4.30 (m, 1H), 4.24 - 4.16 (m, 1H), 4.06 (s, 3H), 3.76 (d, J = 4.1 Hz, 4H), 3.36 (d, J = 4.3 Hz, 4H), 2.49 - 2.32 (m, 1H), 2.28 - 2.16 (m, 1H).
497	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.92 min, m/z = 548 (M+H) ⁺ ; Cl 模式	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d) δ 8.93 (s, 1H), 7.60 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.42 - 7.35 (m, 2H), 7.35 - 7.28 (m, 2H), 7.21 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 7.10 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 6.99 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.39 (q, J = 5.2 Hz, 1H), 4.39 - 4.31 (m, 1H), 4.25 - 4.15 (m, 1H), 4.06 (s, 3H), 3.76 (d, J = 11.3, 6.7, 5.6 Hz, 4H), 3.34 (t, J = 4.3 Hz, 4H), 2.47 - 2.34 (m, 1H), 2.27 - 2.15 (m, 1H).
498	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.98 min, m/z = 564/566 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.18 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.56 (s, 1H), 7.65 (d, J = 2.3 Hz, 3H), 7.53 (dd, J = 13.3, 2.7 Hz, 2H), 7.38 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.26 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.34 - 4.20 (m, 2H), 3.98 (s, 3H), 3.88 (t, J = 4.0 Hz, 4H), 3.31 - 3.20 (m, 4H), 2.28 - 2.16 (m, 1H), 2.12 - 2.01 (m, 1H).
499	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.61 min, m/z = 564/566 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.22 - 9.11 (m, 1H), 8.45 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 7.73 - 7.67 (m, 1H), 7.53 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.47 - 7.40 (m, 1H), 7.35 (d, J = 7.1 Hz, 3H), 7.16 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.25 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 4.25 (dt, J = 7.8, 4.6 Hz, 2H), 3.97 (s, 3H), 3.88 (s, 4H), 3.30 - 3.19 (m, 4H), 2.26 - 2.15 (m, 1H), 2.09 - 2.00 (m, 1H).
500	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.65 min, m/z = 548/550 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.17 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.49 (s, 1H), 7.58 - 7.49 (m, 3H), 7.45 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.39 - 7.31 (m, 2H), 7.17 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.26 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.33 - 4.19 (m, 2H), 3.97 (s, 3H), 3.88 (t, J = 4.2 Hz, 4H), 3.31 - 3.21 (m, 4H), 2.29 - 2.15 (m, 1H), 2.11 - 2.00 (m, 1H).
501	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.42 min, m/z = 522/524 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.11 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.51 (s, 1H), 7.64 (s, 3H), 7.52 - 7.46 (m, 2H), 7.37 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.25 (q, J = 5.8 Hz, 1H), 4.34 - 4.20 (m, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.03 (s, 6H), 2.26 - 2.15 (m, 1H), 2.09 - 2.01 (m, 1H).
502	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.09 min, m/z = 522/524 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.09 (dd, J = 8.0, 5.0 Hz, 1H), 8.40 (s, 1H), 7.69 (dd, J = 8.0, 1.4 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 7.47 - 7.40 (m, 1H), 7.32 (dd, J = 11.9, 5.4 Hz, 3H), 7.16 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.90 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.23 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 4.31 - 4.19 (m, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.04 (s, 6H), 2.25 - 2.13 (m, 1H), 2.06 (d, J = 15.1 Hz, 1H).
503	LC-MS (方法 2): Rt = 3.15 min, m/z = 506 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.56 - 7.48 (m, 3H), 7.42 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 7.34 (t, J = 8.9 Hz, 2H), 7.20 - 7.12 (m, 1H), 6.91 (t, J = 7.1 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.24 (q, J = 5.8 Hz, 1H), 4.31 - 4.19 (m, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.04 (s, 6H), 2.25 - 2.14 (m, 1H), 2.09 - 1.98 (m, 1H).
504	LC-MS (方法 L9): Rt = 4.28 min, m/z = 522/524 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d) δ 9.15 (s, 1H), 8.20 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 7.37 - 7.29 (m, 2H), 7.21 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 26.6, 8.1 Hz, 3H), 5.40 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.40 - 4.31 (m, 1H), 4.26 - 4.16 (m, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.89 (s, 6H), 2.44 - 2.33 (m, 1H), 2.27 - 2.16 (m, 1H).
505	LC-MS (方法 L9): Rt = 4.00 min, m/z = 522/524 (Cl2 模式; (M+H) ⁺)	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d) δ 9.14 (d, J = 5.6 Hz, 1H), 8.33 (dd, J = 21.9, 7.3 Hz, 1H), 7.55 - 7.47 (m, 2H), 7.34 - 7.27 (m, 2H), 7.21 (dd, J = 16.7, 8.0 Hz, 2H), 7.01 - 6.77 (m, 3H), 5.44 - 5.32 (m, 1H), 4.38 - 4.30 (m, 1H), 4.25 - 4.16 (m, 1H), 4.05 (s, 3H), 2.89 (s, 6H), 2.37 (td, J = 9.7, 4.7 Hz, 1H), 2.27 - 2.15 (m, 1H).
506	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.74 min, m/z = 506/508 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d) δ 9.17 (s, 1H), 8.33 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.40 (dd, J = 6.2, 2.6 Hz, 1H), 7.32 (dd, J = 8.5, 4.4 Hz, 2H), 7.24 - 7.16 (m, 1H), 7.10 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 7.01 - 6.84 (m, 3H), 5.39 (q, J = 5.3 Hz, 1H), 4.39 - 4.30 (m, 1H), 4.25 - 4.16 (m, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.88 (s, 6H), 2.43 - 2.32 (m, 1H), 2.26 - 2.16 (m, 1H).
507	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.29 min, m/z = 526/528	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d) δ 8.67 (s, 1H), 7.57 - 7.49 (m, 2H), 7.45 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 7.38 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.30 (dd, J = 7.7, 1.6 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 15.4, 1.7 Hz, 1H), 6.98 - 6.90 (m, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 6.24 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 5.38 (q, J = 5.6 Hz, 1H), 4.40 - 4.31 (m, 1H), 4.25 - 4.15 (m, 1H), 3.06 (s, 6H), 2.46 - 2.34 (m, 1H), 2.27 - 2.16 (m, 1H).

[1937]

508	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.06 min, m/z = 526/528.	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d ₆) δ 8.64 (s, 1H), 7.57 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.51 (dd, J = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.4 Hz, 2H), 7.24 - 7.16 (m, 2H), 6.91 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.85 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 6.31 - 6.15 (m, 1H), 5.41 - 5.30 (m, 1H), 4.39 - 4.26 (m, 1H), 4.18 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 3.06 (s, 6H), 2.44 - 2.33 (m, 1H), 2.25 - 2.14 (m, 1H).
509	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.07 min, m/z = 510/512 (C12 模式, M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d ₆) δ 8.66 (s, 1H), 7.59 - 7.49 (m, 2H), 7.41 - 7.31 (m, 2H), 7.29 (dd, J = 7.7, 1.7 Hz, 1H), 7.24 - 7.16 (m, 1H), 7.11 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 6.96 - 6.89 (m, 1H), 6.85 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 6.23 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.37 (q, J = 5.7 Hz, 1H), 4.39 - 4.30 (m, 1H), 4.23 - 4.14 (m, 1H), 3.06 (s, 6H), 2.44 - 2.33 (m, 1H), 2.25 - 2.15 (m, 1H).
510	LC-MS (方法 L2): R _t = 3.828 min, m/z = 560/562/564 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.23 - 9.11 (m, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.50 - 7.43 (m, 1H), 7.43 - 7.31 (s, 6H), 2.25 - 2.14 (m, 1H), 2.09 - 1.97 (m, 1H).
511	LC-MS (方法 L2): R _t = 3.897 min, m/z = 544/546 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.18 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.68 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.62 - 7.53 (m, 2H), 7.41 - 7.32 (m, 2H), 7.17 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.24 (q, J = 5.6 Hz, 1H), 4.33 - 4.17 (m, 2H), 3.11 (s, 6H), 2.26 - 2.14 (m, 1H), 2.11 - 1.98 (m, 1H).
512	LC-MS (方法 L2): R _t = 4.340 min, m/z = 602/604/606 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.85 (s, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.70 (s, 3H), 7.40 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.18 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.94 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.26 (q, J = 5.6 Hz, 1H), 4.35 - 4.17 (m, 2H), 3.95 - 3.83 (m, 4H), 3.37 - 3.25 (m, 4H), 与信号重叠, 2.29 - 2.16 (m, 1H), 2.14 - 2.02 (m, 1H).
513	LC-MS (方法 L2): R _t = 4.099 min, m/z = 602/604/606 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.31 - 9.22 (m, 1H), 8.75 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 8.55 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.74 (dd, J = 8.0, 1.4 Hz, 1H), 7.52 - 7.44 (m, 1H), 7.44 - 7.33 (m, 2H), 7.17 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.30 - 5.19 (m, 1H), 4.34 - 4.17 (m, 2H), 3.96 - 3.82 (m, 4H), 3.40 - 3.23 (m, 4H), 与信号重叠, 2.29 - 2.15 (m, 1H), 2.12 - 1.97 (m, 1H).
514		¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.27 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.78 (s, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.65 - 7.54 (m, 2H), 7.44 - 7.33 (m, 2H), 7.17 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.26 (q, J = 5.7 Hz, 1H), 4.34 - 4.16 (m, 2H), 3.95 - 3.82 (m, 4H), 3.39 - 3.23 (m, 4H), 与信号重叠, 2.29 - 2.16 (m, 1H), 2.13 - 2.00 (m, 1H).
517	LC-MS (方法 L2): R _t = 3.180 min, m/z = 550/552/554 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 10.23 (s, 1H), 9.17 - 9.07 (m, 1H), 8.37 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.0, 1.5 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.47 - 7.38 (m, 1H), 7.38 - 7.26 (m, 2H), 7.22 - 7.11 (m, 2H), 6.91 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.24 (q, 1H), 4.34 - 4.18 (m, 2H), 3.92 - 3.77 (m, 4H), 3.30 - 3.16 (m, 4H), 2.28 - 2.12 (m, 1H), 2.11 - 1.95 (m, 1H).
528	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.588 min, m/z = 491/493 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.91 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.50 - 7.41 (m, 1H), 7.35 - 7.29 (m, 2H), 7.29 - 7.19 (m, 1H), 7.19 - 7.08 (m, 2H), 6.89 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.77 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.47 (s, 2H), 5.25 - 5.15 (m, 1H), 4.30 - 4.17 (m, 2H), 2.99 (s, 6H), 2.21 - 2.10 (m, 1H), 2.06 - 1.93 (m, 1H).
529	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.722 min, m/z = 507/509/511 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.91 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.31 (s, 1H), 7.91 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.56 (t, J = 1.7 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.22 (d, J = 1.6 Hz, 2H), 7.19 - 7.07 (m, 2H), 6.90 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.48 (s, 2H), 5.20 (q, J = 6.0 Hz, 1H), 4.27 - 4.19 (m, 2H), 2.98 (s, 6H), 2.21 - 2.10 (m, 1H), 2.05 - 1.95 (m, 1H).
530	LC-MS (方法 L10) Rt = 1.91 min, m/z = 564 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d ₆) δ 8.93 (s, 1H), 7.59 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 7.39 - 7.28 (m, 4H), 7.26 - 7.16 (m, 2H), 7.01 - 6.82 (m, 3H), 5.51 - 5.20 (m, 1H), 4.48 - 4.28 (m, 1H), 4.28 - 4.12 (m, 1H), 4.05 (s, 3H), 3.76 (dt, J = 8.1, 4.7 Hz, 6H), 3.34 (t, J = 4.5 Hz, 6H), 2.55 - 2.33 (m, 1H), 2.33 - 2.14 (m, 1H).
531	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.76 min, m/z = 552/554 (C12 模式, M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d ₆) δ 8.63 (s, 1H), 7.62 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.54 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 2H), 7.30 (dd, J = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 7.23 - 7.17 (m, 1H), 7.15 - 7.07 (m, 1H), 6.93 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.1, 1.2 Hz, 1H), 6.20 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.38 (q, J = 5.6 Hz, 1H), 4.40 - 4.31 (m, 1H), 4.24 - 4.14 (m, 1H), 4.15 - 3.75 (m, 4H), 3.43 (s, 4H), 2.46 - 2.35 (m, 1H).

[1938]

532	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.74 min, m/z = 568/570 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d ₆) δ 8.61 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 7.63 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.52 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.33 - 7.27 (m, 2H), 7.20 (td, J = 7.6, 1.7 Hz, 2H), 6.96 - 6.82 (m, 2H), 6.20 (t, J = 6.5 Hz, 1H), 5.42 - 5.33 (m, 1H), 4.39 - 4.31 (m, 1H), 4.23 - 4.13 (m, 1H), 3.99 (d, J = 50.2 Hz, 4H), 3.44 (s, 4H), 2.46 - 2.34 (m, 1H), 2.26 - 2.16 (m, 1H).
533	LC-MS (方法 L9): Rt = 4.38 min, m/z = 568/570 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d ₆) δ 8.65 (s, 1H), 7.60 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.43 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 7.39 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.31 (dd, J = 7.6, 1.6 Hz, 1H), 7.21 (dd, J = 15.6, 1.7 Hz, 1H), 6.98 - 6.91 (m, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 6.20 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.39 (q, J = 5.6 Hz, 1H), 4.41 - 4.33 (m, 1H), 4.25 - 4.16 (m, 1H), 3.95 (s, 4H), 3.43 (s, 4H), 2.47 - 2.36 (m, 1H), 2.29 - 2.19 (m, 1H).
536	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.60 min, m/z = 533/535 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.99 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.98 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.50 - 7.43 (m, 1H), 7.33 (dt, J = 7.8, 4.6 Hz, 2H), 7.28 - 7.22 (m, 1H), 7.15 (t, J = 7.9 Hz, 2H), 6.90 (t, J = 7.0 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 5.27 - 5.17 (m, 1H), 4.24 (dt, J = 8.6, 4.0 Hz, 2H), 3.83 (s, 4H), 3.28 - 3.15 (m, 4H), 2.24 - 2.12 (m, 1H), 2.06 - 1.95 (m, 1H).
537	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.67 min, m/z = 549/551 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.00 (dd, J = 8.3, 2.3 Hz, 1H), 8.31 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.64 (dd, J = 8.1, 1.4 Hz, 1H), 7.41 (td, J = 7.8, 5.9 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.21 - 7.11 (m, 3H), 6.89 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.77 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.37 (s, 2H), 5.21 (q, J = 6.0 Hz, 1H), 4.25 (t, J = 8.5 Hz, 2H), 3.82 (s, 4H), 3.28 - 3.16 (m, 4H), 2.23 - 2.12 (m, 1H), 2.06 - 1.95 (m, 1H).
538	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.72 min, m/z = 549/551 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.98 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 7.96 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.57 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.33 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.22 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 7.18 - 7.11 (m, 2H), 6.95 - 6.87 (m, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.54 (s, 2H), 5.22 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.31 - 4.18 (m, 2H), 3.82 (s, 4H), 3.28 - 3.14 (m, 4H), 2.19 (dq, J = 13.4, 4.8 Hz, 1H), 2.02 (dq, J = 10.4, 3.7, 3.3 Hz, 1H).
551	LC-MS (方法 L2): 2.66 min, m/z = 507/509 (M+1) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8.92 (dd, J = 8.4, 2.4 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.93 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.63 (dd, J = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.47 - 7.37 (m, 1H), 7.30 (dd, J = 7.6, 1.6 Hz, 1H), 7.23 - 7.07 (m, 3H), 6.88 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.77 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 5.31 (d, J = 2.5 Hz, 2H), 5.20 (q, J = 6.2 Hz, 1H), 4.24 (t, J = 5.9 Hz, 2H), 2.99 (s, 6H), 2.23 - 2.10 (m, 1H), 2.06 - 1.92 (m, 1H).
559	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.60 min, m/z = 492 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 10.37 (s, 1H), 8.98 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.09 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.48 - 7.40 (m, 1H), 7.35 - 7.24 (m, 4H), 7.18 - 7.12 (m, 1H), 6.90 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.21 (dd, J = 7.9, 5.1 Hz, 1H), 4.30 - 4.18 (m, 2H), 3.03 (s, 6H), 2.22 - 2.12 (m, 1H), 2.06 - 1.96 (m, 1H).
560	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.66 min, m/z = 508/510 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 10.20 (s, 1H), 8.98 (dd, J = 8.3, 2.4 Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 8.08 (d, J = 9.2 Hz, 1H), 7.61 (dd, J = 8.0, 1.5 Hz, 1H), 7.41 - 7.27 (m, 3H), 7.23 - 7.11 (m, 2H), 6.89 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.77 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.21 (q, J = 6.4 Hz, 1H), 4.25 (td, J = 9.4, 8.0, 5.5 Hz, 2H), 3.03 (s, 6H), 2.22 - 2.11 (m, 1H), 2.06 - 1.94 (m, 1H).
561	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.74 min, m/z = 508/510 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 10.33 (s, 1H), 8.98 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.07 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.54 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.37 - 7.28 (m, 4H), 7.19 - 7.13 (m, 1H), 6.91 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.2, 1.1 Hz, 1H), 5.26 - 5.18 (m, 1H), 4.30 - 4.19 (m, 2H), 3.02 (s, 6H), 2.23 - 2.12 (m, 1H), 2.07 - 1.97 (m, 1H).
580	LC-MS (方法 M11): Rt = 1.52 min, m/z = 570 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm] = 2.04-2.09 (m, 1H), 2.17-2.30 (m, 1H), 3.07 (s, 6H), 4.22-4.32 (m, 2H), 5.21-5.26 (m, 1H), 6.79 (d, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.64-7.68 (m, 4H), 7.81 (dd, 1H), 8.25 (dd, 1H), 8.66 (s, 1H), 9.13 (d, 1H).
581	LC-MS (方法 M11): Rt = 1.29 min, m/z = 492 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (300 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 3.06 (s, 6H), 3.87 (dd, 1H), 4.05 (dd, 1H), 4.75 (d, 2H), 5.18-5.21 (m, 1H), 7.09-7.13 (m, 1H), 7.25-7.30 (m, 2H), 7.47-7.50 (m, 1H), 7.62-7.67 (m, 4H), 7.80 (dd, 1H), 8.23 (dd, 1H), 8.62 (s, 1H), 9.11 (d, 1H).
584	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.79 min, m/z = 534 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d ₆) δ 8.90 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.21 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.47 - 7.40 (m, 1H), 7.40 - 7.34 (m, 1H), 7.34 - 7.27 (m, 2H), 7.25 - 7.17 (m, 3H), 6.92 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.46 (s, 1H), 5.36 (dd, J = 7.6, 4.4 Hz, 1H), 4.38 - 4.30 (m, 1H), 4.22 - 4.14 (m, 1H), 3.84 (q, J = 5.9 Hz, 4H), 3.40 (q, J = 4.4 Hz, 4H), 2.43 - 2.33 (m, 1H), 2.27 - 2.16 (m, 1H).
609	LC-MS (方法 L10): Rt = 3.98 min, m/z = 602 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.19 (dd, J = 8.1, 2.7 Hz, 1H), 8.68 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.44 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.77 (dt, J = 9.3, 1.6 Hz, 1H), 7.62 - 7.56 (m, 1H), 7.49 - 7.34 (m, 3H), 7.20 - 7.14 (m, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.37 - 5.10 (m, 1H), 4.32 - 4.18 (m, 2H), 3.88 (t, J = 4.8 Hz, 4H), 3.32 - 3.25 (m, 4H), 2.27 - 2.17 (m, 1H), 2.09 - 2.00 (m, 1H).

[1939]

610	LC-MS (方法 L10): R _t = 4.00 min; m/z = 618/620 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.19 (dd, J = 8.1, 4.2 Hz, 1H), 8.65 (d, J = 3.7 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.76 (td, J = 8.8, 8.0, 1.6 Hz, 2H), 7.48 (td, J = 7.9, 5.1 Hz, 1H), 7.38 - 7.29 (m, 2H), 7.26 - 7.06 (m, 1H), 6.91 (t, J = 7.5, 1.5 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 5.23 (d, J = 6.5 Hz, 1H), 4.31 - 4.19 (m, 2H), 3.98 - 3.77 (m, 4H), 3.32 - 3.23 (m, 4H), 2.26 - 2.16 (m, 1H), 2.08 - 1.99 (m, 1H).
611	LC-MS (方法 L10): R _t = 4.20 min; m/z = 618/620 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.19 (dd, J = 8.1 Hz, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.41 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.84 - 7.66 (m, 2H), 7.39 (dd, J = 19.0, 1.8 Hz, 3H), 7.22 - 7.13 (m, 1H), 6.96 - 6.88 (m, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.24 (q, J = 6.0 Hz, 1H), 4.32 - 4.19 (m, 2H), 3.98 - 3.71 (m, 4H), 3.32 - 3.22 (m, 4H), 2.27 - 2.17 (m, 1H), 2.10 - 2.01 (m, 1H).
612	LC-MS (方法 L10): R _t = 3.67 min; m/z = 560 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.10 (dd, J = 8.2, 2.8 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.41 (d, J = 9.5 Hz, 1H), 7.71 (dq, J = 9.3, 1.5 Hz, 1H), 7.61 - 7.55 (m, 1H), 7.47 - 7.33 (m, 3H), 7.16 (td, J = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 6.91 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.22 (dt, J = 8.4, 4.3 Hz, 1H), 4.31 - 4.18 (m, 2H), 3.09 (s, 6H), 2.25 - 2.14 (m, 1H), 2.09 - 1.91 (m, 1H).
613	LC-MS (方法 L10): R _t = 3.60 min; m/z = 576/578 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.11 (dd, J = 8.2, 3.8 Hz, 1H), 8.56 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 8.40 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.76 - 7.68 (m, 2H), 7.47 (td, J = 7.9, 5.1 Hz, 1H), 7.36 - 7.28 (m, 2H), 7.19 - 7.12 (m, 1H), 6.90 (t, J = 7.3, 1.5 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.2, 1.2 Hz, 1H), 5.22 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 4.31 - 4.17 (m, 2H), 3.09 (s, 6H), 2.19 (td, J = 9.1, 8.7, 3.9 Hz, 1H), 2.08 - 1.96 (m, 1H).
614	LC-MS (方法 L10): R _t = 3.82 min; m/z = 576/578 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.10 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.38 (d, J = 9.4 Hz, 1H), 7.70 (td, J = 4.4, 2.2 Hz, 2H), 7.40 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 7.35 (dd, J = 8.8, 1.6 Hz, 1H), 7.20 - 7.13 (m, 1H), 6.91 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.23 (q, J = 6.2 Hz, 1H), 4.31 - 4.19 (m, 2H), 3.08 (s, 6H), 2.24 - 2.14 (m, 1H), 2.08 - 1.99 (m, 1H).
615	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.79 min, m/z = 550/552 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 10.24 (s, 1H), 9.06 (dd, J = 8.3, 2.9 Hz, 1H), 8.43 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 7.9, 1.6 Hz, 1H), 7.45 - 7.30 (m, 3H), 7.24 - 7.11 (m, 2H), 6.90 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 5.22 (q, J = 6.3 Hz, 1H), 4.30 - 4.19 (m, 2H), 3.85 (q, J = 4.8, 3.8 Hz, 4H), 3.30 - 3.18 (m, 4H), 2.24 - 2.13 (m, 1H), 2.09 - 1.96 (m, 1H).
616	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.92 min, m/z = 550/552 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 10.36 (s, 1H), 9.06 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.51 (s, 1H), 8.13 (d, J = 9.3 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.41 - 7.30 (m, 4H), 6.92 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.23 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.32 - 4.19 (m, 2H), 4.04 (s, 1H), 3.90 - 3.79 (m, 4H), 3.24 (q, J = 5.3 Hz, 4H), 2.22 - 2.14 (m, 1H), 2.09 - 1.98 (m, 1H).
617	LC-MS (方法 L9): R _t = 4.03 min, m/z = 517/519 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9.16 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.67 (s, 1H), 8.36 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.77 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.58 (s, 2H), 7.35 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.23 (q, J = 6.2 Hz, 1H), 4.31 - 4.19 (m, 2H), 3.08 (s, 6H), 2.25 - 2.14 (m, 1H), 2.09 - 1.98 (m, 1H).
618	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.818 min; m/z = 492/494/496 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 10.18 (s, 1H), 9.06 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.55 - 7.44 (m, 3H), 7.38 - 7.29 (m, 2H), 7.25 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.16 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.91 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 5.24 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.31 - 4.17 (m, 2H), 3.00 (s, 6H), 2.26 - 2.13 (m, 1H), 2.09 - 1.95 (m, 1H).
619	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.836 min; m/z = 508/510/512 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 10.16 (s, 1H), 9.10 - 9.00 (m, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.48 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.47 - 7.36 (m, 1H), 7.36 - 7.27 (m, 2H), 7.20 - 7.10 (m, 2H), 6.90 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.78 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.29 - 5.16 (m, 1H), 4.31 - 4.15 (m, 2H), 3.00 (s, 6H), 2.17 (dd, J = 8.6, 4.2 Hz, 1H), 2.01 (d, J = 13.7 Hz, 1H).
620	LC-MS (方法 M24): R _t = 1.34 min; m/z = 510 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, CD ₃ OD-d ₄): δ [ppm] = 2.22-2.25 (m, 1H), 2.31-2.35 (m, 1H), 3.18 (s, 6H), 4.29-4.34 (m, 1H), 4.38-4.43 (m, 1H), 5.36 (t, 1H), 6.86-6.92 (m, 1H), 6.98-7.03 (m, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.63 (dd, 1H), 7.71 (dd, 1H), 8.28 (dd, 1H), 8.55 (s, 1H).
621	LC-MS (方法 M47): R _t = 2.86 min; m/z = 560 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, CD ₃ OD-d ₄): δ [ppm] = 2.20-2.26 (m, 1H), 2.29-2.35 (m, 1H), 3.19 (s, 6H), 4.33-4.39 (m, 1H), 4.43-4.48 (m, 1H), 5.35 (t, 1H), 7.33-7.36 (m, 2H), 7.47 (t, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.63 (dd, 1H), 7.72 (dd, 1H), 8.29 (dd, 1H), 8.56 (s, 1H).
622	LC-MS (方法 M24): R _t = 1.43 min; m/z = 526 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, CD ₃ OD-d ₄): δ [ppm] = 2.16-2.21 (m, 1H), 2.27-2.32 (m, 1H), 3.19 (s, 6H), 4.23-4.34 (m, 2H), 5.32 (t, 1H), 6.80 (d, 1H), 7.15 (dd, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.63 (dd, 1H), 7.72 (dd, 1H), 8.29 (dd, 1H), 8.56 (1 H, s).

[1940]

623	LC-MS (方法 M47): Rt = 2.86 min; m/z = 510 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (300 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 1.99-2.05 (1H, m), 2.18-2.21 (m, 1H), 3.06 (s, 6H), 4.19-4.27 (m, 2H), 5.19-5.24 (m, 1H), 6.84 (dd, 1H), 7.00-7.07 (m, 1H), 7.17-7.22 (dd, 1H), 7.64-7.68 (m, 4H), 7.81 (dd, 1H), 8.24 (dd, 1H), 8.68 (s, 1H), 9.13 (d, 1H).
626	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.240 min; m/z = 534/536/538 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ 10.25 (s, 1H), 9.12 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.40 (s, 1H), 7.58 - 7.49 (m, 2H), 7.47 (dd, J = 6.2, 2.7 Hz, 1H), 7.40 - 7.29 (m, 2H), 7.27 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.16 (t, 1H), 6.92 (t, J = 5.1 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.26 (q, 1H), 4.33 - 4.18 (m, 2H), 3.93 - 3.77 (m, 4H), 3.30 - 3.15 (m, 4H), 2.28 - 2.14 (m, 1H), 2.12 - 1.97 (m, 1H).
627	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.529 min; m/z = 550/552/554 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ 10.41 (s, 1H), 9.12 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.46 (s, 1H), 7.63 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.60 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 7.52 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.17 (t, 1H), 6.93 (t, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.25 (q, 1H), 4.33 - 4.18 (m, 2H), 3.89 - 3.74 (m, 4H), 3.27 - 3.13 (m, 4H), 2.29 - 2.12 (m, 1H), 2.12 - 1.98 (m, 1H).
632	LC-MS (方法 M30): Rt = 1.65 min; m/z = 526 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (300 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 2.07-2.11 (m, 1H), 2.23-2.27 (m, 1H), 3.06 (s, 6H), 4.31-4.45 (m, 2H), 5.28 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.35 (t, 2H), 7.63-7.67 (m, 4H), 7.81 (d, 1H), 8.24 (d, 1H), 8.64 (s, 1H), 9.12 (d, 1H).
633	LC-MS (方法 M14): Rt = 1.43 min; m/z = 570 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 2.06-2.10 (m, 1H), 2.20-2.24 (m, 1H), 3.06 (s, 6H), 4.31-4.44 (m, 2H), 5.26-5.31 (m, 1H), 6.88 (t, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.63-7.67 (m, 4H), 7.80 (d, 1H), 8.24 (d, 1H), 8.64 (s, 1H), 9.13 (d, 1H).
634	LC-MS (方法 M14): Rt = 1.43 min; m/z = 570 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 2.06-2.10 (m, 1H), 2.20-2.24 (m, 1H), 3.06 (s, 6H), 4.31-4.44 (m, 2H), 5.26-5.31 (m, 1H), 6.88 (t, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.63-7.67 (m, 4H), 7.80 (d, 1H), 8.24 (d, 1H), 8.64 (s, 1H), 9.13 (d, 1H).
642	LC-MS (方法 L9): Rt = 3.75 min; m/z = 543/545 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ 9.24 (dd, J = 8.1, 2.0 Hz, 1H), 8.74 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.42 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.04 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.69 - 7.60 (m, 2H), 7.46 (td, J = 9.3, 7.0 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 7.6, 1.6 Hz, 1H), 7.20 - 7.14 (m, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.24 (dq, J = 10.3, 5.4 Hz, 1H), 4.31 - 4.18 (m, 2H), 3.88 (t, J = 4.5 Hz, 4H), 3.29 (d, J = 4.8 Hz, 4H), 2.28 - 2.15 (m, 1H), 2.05 (s, 1H).
651	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.79 min; m/z = 534 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d ₇): δ 8.80 (s, 1H), 8.11 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.45 - 7.37 (m, 2H), 7.31 (dd, J = 7.8, 1.7 Hz, 1H), 7.24 - 7.18 (m, 1H), 7.15 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 6.97 - 6.91 (m, 1H), 6.87 (dd, J = 8.1, 1.2 Hz, 1H), 6.21 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.45 - 5.38 (m, 1H), 4.49 (s, 2H), 4.41 - 4.33 (m, 1H), 4.24 - 4.15 (m, 1H), 3.86 (s, 2H), 3.68 (s, 2H), 3.17 (s, 2H), 2.51 - 2.37 (m, 1H), 2.30 - 2.22 (m, 1H).
652	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.88 min; m/z = 559/561 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ 9.24 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.76 (s, 1H), 8.39 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 8.8 Hz, 1H), 7.78 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.59 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 7.37 (dd, J = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 7.20 - 7.14 (m, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.1, 1.2 Hz, 1H), 5.28 - 5.21 (m, 1H), 4.32 - 4.18 (m, 2H), 3.88 (t, J = 4.8 Hz, 4H), 3.31 - 3.24 (m, 4H), 2.26 - 2.18 (m, 1H), 2.09 - 2.01 (m, 1H).
656	LC-MS (方法 L2): Rt = 2.697 min; m/z = 448/450 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ 13.31 (s, 1H), 9.19 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.69 (s, 1H), 8.51 (dd, J = 7.4, 1.4 Hz, 1H), 8.17 (dd, J = 8.5, 1.5 Hz, 1H), 7.65 (t, J = 8.4, 7.4 Hz, 1H), 7.36 (dd, J = 7.9, 1.6 Hz, 1H), 7.32 (s, 1H), 7.19 (ddd, J = 8.7, 7.4, 1.7 Hz, 1H), 6.95 (t, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.2, 1.1 Hz, 1H), 5.28 (q, J = 5.8 Hz, 1H), 4.34 - 4.19 (m, 2H), 3.09 (s, 6H), 2.28 - 2.16 (m, 1H), 2.12 - 2.00 (m, 1H).
657	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.83 min; m/z = 559/561 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d ₇): δ 8.77 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 8.12 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.70 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 8.1, 1.5 Hz, 1H), 7.36 - 7.27 (m, 2H), 7.24 - 7.17 (m, 2H), 6.93 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.1 Hz, 1H), 6.21 (t, J = 6.6 Hz, 1H), 5.41 (t, J = 6.2 Hz, 1H), 4.50 (s, 2H), 4.40 - 4.32 (m, 1H), 4.24 - 4.14 (m, 1H), 3.87 (s, 2H), 3.69 (s, 2H), 3.31 - 3.03 (m, 2H), 2.42 (dd, J = 12.0, 6.7 Hz, 1H), 2.31 - 2.18 (m, 1H).
658	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.86 min; m/z = 501 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, 氘仿 -d ₇): δ 8.83 (s, 1H), 8.10 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.47 - 7.39 (m, 2H), 7.31 (dd, J = 7.9, 1.6 Hz, 1H), 7.26 - 7.21 (m, 1H), 7.20 - 7.13 (m, 1H), 6.99 - 6.92 (m, 1H), 6.89 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 6.23 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 5.41 (q, J = 5.6 Hz, 1H), 4.38 (dq, J = 10.3, 3.3 Hz, 1H), 4.26 - 4.18 (m, 1H), 3.08 (s, 6H), 2.48 - 2.38 (m, 1H), 2.30 - 2.21 (m, 1H).

[1941]

659	LC-MS (方法 L2): R _t = 3.89 min; m/z = 517/519 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, 氯仿-d) δ 8.78 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 8.08 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.57 (dd, J = 8.1, 1.5 Hz, 1H), 7.36 - 7.29 (m, 1H), 7.24 - 7.17 (m, 2H), 6.96 - 6.89 (m, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 1.1 Hz, 1H), 6.21 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 5.38 (s, 1H), 4.39 - 4.31 (m, 1H), 4.23 - 4.14 (m, 1H), 3.07 (s, 6H), 2.47 - 2.35 (m, 1H), 2.26 - 2.16 (m, 1H).
660	LC-MS (方法 L2): R _t = 3.65 min; m/z = 491 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.26 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.87 (s, 1H), 7.91 - 7.87 (m, 1H), 7.84 - 7.73 (m, 2H), 7.70 - 7.57 (m, 1H), 7.35 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.30 - 7.23 (m, 1H), 7.19 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 6.93 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 5.31 - 5.11 (m, 4H), 4.84 - 4.70 (m, 2H), 4.34 - 4.21 (m, 2H), 2.25 - 2.15 (m, 1H), 2.08 - 2.01 (m, 1H).
662	LC-MS (方法 L2): R _t = 3.91 min; m/z = 561 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.22 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.29 (dd, J = 8.3, 1.7 Hz, 1H), 7.96 - 7.87 (m, 2H), 7.68 - 7.60 (m, 1H), 7.48 - 7.43 (m, 1H), 7.31 - 7.25 (m, 1H), 7.21 - 7.14 (m, 1H), 6.92 (td, J = 7.5, 1.2 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.2, 1.1 Hz, 1H), 5.27 (q, J = 6.0 Hz, 1H), 4.34 - 4.19 (m, 2H), 2.23 (dp, J = 13.4, 4.3 Hz, 1H), 2.16 - 2.06 (m, 1H).
663	LC-MS (方法 L2): R _t = 4.04 min; m/z = 559/561 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.35 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.87 (s, 1H), 8.28 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.99 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.72 (t, J = 1.9 Hz, 1H), 7.67 (d, J = 1.9 Hz, 2H), 7.45 - 7.38 (m, 1H), 7.22 - 7.15 (m, 1H), 6.94 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.84 - 6.78 (m, 1H), 5.28 (q, J = 6.1 Hz, 1H), 4.34 - 4.17 (m, 4H), 3.78 (d, J = 10.9 Hz, 2H), 3.52 (s, 2H), 3.09 (s, 2H), 2.29 - 2.20 (m, 1H), 2.14 - 2.05 (m, 1H).
664	LC-MS (方法 L2): R _t = 4.11 min; m/z = 517/519 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.28 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.86 (s, 1H), 8.26 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.98 (d, J = 7.5 Hz, 1H), 7.72 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.69 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 7.39 (d, J = 7.3 Hz, 1H), 7.22 - 7.15 (m, 1H), 6.93 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.81 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 5.26 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.31 - 4.22 (m, 2H), 2.91 (s, 6H), 2.27 - 2.15 (m, 1H), 2.14 - 2.01 (m, 1H).
665	LC-MS (方法 M29): R _t = 2.82 min; m/z = 510 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (300 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 3.05 (s, 6H), 3.88 (dd, 1H), 4.79 (d, 2H), 5.19-5.22 (m, 1H), 7.11-7.17 (m, 1H), 7.36 (dd, 2H), 7.62-7.67 (m, 4H), 7.80 (dd, 1H), 8.23 (dd, 1H), 8.63 (s, 1H), 9.14 (d, 1H).
677	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.83 min; m/z = 504 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.19 (dd, J = 8.3, 4.4 Hz, 1H), 8.80 - 8.67 (m, 2H), 7.83 (dd, J = 7.1, 1.2 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 8.6, 7.0 Hz, 1H), 7.61 (ddd, J = 11.0, 5.9, 3.0 Hz, 1H), 7.35 (dd, J = 7.7, 2.1 Hz, 1H), 7.22 (dp, J = 7.8, 2.4 Hz, 1H), 7.19 - 7.14 (m, 1H), 6.92 (dd, J = 8.0, 6.8 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.2, 1.2 Hz, 1H), 5.29 (q, J = 6.4 Hz, 1H), 4.26 (td, J = 7.4, 7.0, 3.3 Hz, 2H), 3.99 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 3.31 - 3.22 (m, 4H), 3.02 (q, J = 8.3 Hz, 1H), 2.26 - 2.10 (m, 3H), 2.09 - 2.00 (m, 1H).
678	LC-MS (方法 L11): R _t = 3.80 min 和 3.84 min; m/z = 505 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.29 - 9.14 (m, 1H), 8.75 (s, 1H), 8.53 - 8.19 (m, 1H), 7.97 - 7.71 (m, 2H), 7.61 (qd, J = 8.8, 3.3 Hz, 1H), 7.37 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.20 (dt, J = 27.0, 6.7 Hz, 2H), 6.93 (t, J = 7.5, 1.4 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.2, 1.2 Hz, 1H), 5.30 (q, J = 6.2 Hz, 1H), 4.34 (p, J = 8.8, 8.2 Hz, 1H), 4.27 - 4.13 (m, 3H), 4.02 (dt, J = 29.8, 9.3 Hz, 1H), 3.87 - 3.56 (m, 1H), 3.25 - 3.15 (m, 1H), 2.44 - 2.36 (m, 1H), 2.32 - 2.18 (m, 2H), 2.10 - 2.01 (m, 1H).
679	LC-MS (方法 L2): R _t = 2.83 min; m/z = 532 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 9.14 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.53 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.80 (dt, J = 15.6, 7.2 Hz, 2H), 7.61 (dq, J = 12.7, 8.0, 6.9 Hz, 1H), 7.40 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.25 - 7.13 (m, 2H), 6.93 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 6.79 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 5.31 (q, J = 6.5 Hz, 1H), 4.31 - 4.19 (m, 2H), 2.94 (t, J = 11.7 Hz, 2H), 2.44 (d, J = 13.3 Hz, 3H), 2.25 (s, 4H), 2.00 (dt, J = 23.1, 11.4 Hz, 3H), 1.77 (dd, J = 22.3, 12.8 Hz, 2H).
680	LC-MS (方法 L9): R _t = 3.973 min; m/z = 550/552 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 13.95 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 9.35 (dd, J = 8.2, 2.8 Hz, 1H), 8.67 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 7.66 (dd, J = 8.0, 1.5 Hz, 1H), 7.55 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.44 - 7.34 (m, 2H), 7.30 (t, J = 7.4, 1.5 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 6.96 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.7 Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.2, 1.2 Hz, 1H), 5.25 (q, 1H), 4.35 - 4.15 (m, 2H), 3.85 (bs, 4H), 3.32 (bs, 4H); 与水信号重叠。
681	LC-MS (方法 L2): R _t = 4.067 min; m/z = 550/552 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 14.16 (s, 1H), 9.36 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.79 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 8.1, 1.6 Hz, 1H), 7.61 - 7.54 (m, 3H), 7.41 (d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.22 - 7.14 (m, 1H), 6.99 - 6.90 (m, 2H), 6.81 (dd, J = 8.2, 1.4 Hz, 1H), 5.28 (q, J = 6.3 Hz, 1H), 4.35 - 4.18 (m, 2H), 3.85 (bs, 4H), 3.32 (bs, 4H); 与水信号重叠。
682	LC-MS (方法 L9): R _t = 4.036 min; m/z = 508/510 (M+H) ⁺ .	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 14.15 (s, 1H), 9.30 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.67 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.53 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.44 - 7.33 (m, 2H), 7.33 - 7.26 (m, 1H), 7.17 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 7.9, 2.9 Hz, 2H), 6.79 (dd, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 5.24 (q, J = 6.0 Hz, 1H), 4.31 - 4.20 (m, 2H), 2.99 (s, 6H), 2.23 - 2.15 (m, 1H), 2.09 - 1.99 (m, 1H).

[1942]

683	LC-MS (方法 L2): Rt = 3.335 min; m/z = 508/510 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ 14.36 (s, 1H), 9.32 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 8.79 (s, 1H), 7.74 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.61 - 7.57 (m, 2H), 7.57 - 7.54 (m, 1H), 7.39 (dd, J = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 7.18 (d, J = 7.8, 7.3, 1.7 Hz, 1H), 6.97 - 6.90 (m, 2H), 6.81 (d, J = 8.2, 1.2 Hz, 1H), 5.26 (q, J = 5.9 Hz, 1H), 4.33 - 4.18 (m, 2H), 2.99 (s, 6H), 2.27 - 2.16 (m, 1H), 2.13 - 2.02 (m, 1H).
689	LC-MS (方法 M48): Rt = 2.70 min; m/z = 556 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 2.10-2.11 (m, 1H), 2.20-2.25 (m, 1H), 3.20-3.25 (m, 4H), 3.73-3.74 (m, 4H), 4.24-4.32 (m, 2H), 5.24 (q, 1H), 6.81 (dd, 1H), 6.95 (t, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.54-7.55 (m, 1H), 7.77-7.83 (m, 2H), 8.68 (s, 1H), 9.24 (d, 1H).
690	LC-MS (方法 M29): Rt = 2.91 min; m/z = 514 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 2.05-2.10 (m, 1H), 2.19-2.22 (m, 1H), 2.97 (s, 6H), 4.23-4.29 (m, 2H), 5.22-5.24 (m, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.17-7.21 (m, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.72-7.75 (m, 2H), 8.59 (s, 1H), 9.14 (d, 1H).
691	LC-MS (方法 M48): Rt = 2.41 min; m/z = 570 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 2.06-2.10 (m, 1H), 2.20-2.24 (m, 1H), 3.27-3.32 (m, 4H), 3.72-3.73 (m, 4H), 4.24-4.29 (m, 2H), 5.24 (q, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.95-6.97 (m, 1H), 7.17-7.19 (m, 1H), 7.39-7.40 (m, 1H), 7.70-7.78 (m, 4H), 8.65 (s, 1H), 9.24 (d, 1H).
692	LC-MS (方法 M7): Rt = 1.67 min; m/z = 528 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, CD ₃ OD-d4): δ [ppm] = 2.18-2.23 (m, 1H), 2.26-2.33 (m, 1H), 3.09 (d, 6H), 4.24-4.32 (m, 2H), 5.30 (t, 1H), 6.80-6.83 (m, 1H), 6.91-6.96 (m, 1H), 7.15-7.20 (m, 1H), 7.33-7.36 (m, 1H), 7.50-7.58 (m, 4H), 8.50 (s, 1H).
693	LC-MS (方法 M7): Rt = 1.71 min; m/z = 570 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 2.08-2.10 (m, 1H), 2.22-2.25 (m, 1H), 3.20-3.32 (m, 4H), 3.70 (s, 4H), 4.23-4.30 (m, 2H), 5.24 (q, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.63-7.65 (m, 1H), 7.78-7.85 (m, 2H), 8.68 (s, 1H), 9.22 (t, 1H).
694	LC-MS (方法 M7): Rt = 1.61 min; m/z = 528 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 2.05-2.07 (m, 1H), 2.18-2.21 (m, 1H), 2.97 (s, 6H), 4.23-4.29 (m, 2H), 5.21 (q, 1H), 6.81 (d, 1H), 6.94 (t, 1H), 7.19 (t, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.53-7.57 (m, 1H), 7.63-7.64 (m, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.81-7.84 (m, 1H), 8.58 (s, 1H), 9.12-9.14 (m, 1H).
374	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.38 min; m/z = 602 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (1.57), -0.008 (14.94), 0.008 (13.32), 0.146 (1.57), 2.038 (0.71), 2.103 (0.71), 2.179 (0.86), 2.214 (1.11), 2.327 (1.52), 2.366 (1.11), 2.523 (4.71), 2.670 (1.62), 2.694 (1.01), 2.709 (1.16), 3.363 (2.08), 3.379 (1.47), 3.405 (1.47), 3.436 (1.52), 3.462 (1.37), 3.490 (0.76), 4.120 (3.70), 4.204 (0.96), 4.258 (1.67), 4.278 (1.92), 4.287 (1.97), 4.645 (0.96), 5.243 (1.06), 5.285 (0.96), 6.798 (3.54), 6.818 (4.00), 6.861 (0.86), 6.879 (1.77), 6.899 (1.06), 6.924 (0.91), 6.945 (1.82), 6.961 (1.11), 7.160 (1.06), 7.178 (1.67), 7.188 (1.77), 7.285 (1.47), 7.304 (1.32), 7.418 (1.57), 7.435 (1.52), 7.646 (14.89), 7.648 (16.00), 7.681 (0.86), 7.717 (2.43), 7.735 (3.49), 7.756 (3.14), 7.868 (4.00), 7.886 (3.19), 8.329 (1.87), 8.346 (2.53), 8.363 (1.57), 8.773 (6.43), 8.786 (6.73), 8.962 (0.61), 9.262 (1.82), 9.282 (3.29), 9.303 (1.57).
375	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.93 min; MS (ESIpos): m/z = 536 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.028 (0.47), 2.050 (0.77), 2.065 (0.73), 2.132 (0.72), 2.145 (0.85), 2.160 (0.51), 3.644 (16.00), 4.253 (1.62), 4.264 (2.51), 4.279 (1.47), 4.388 (1.53), 4.404 (1.52), 4.412 (1.50), 4.429 (1.52), 5.206 (0.44), 5.221 (0.97), 5.240 (0.94), 5.255 (0.45), 5.754 (0.63), 6.782 (1.85), 6.802 (2.07), 6.891 (0.88), 6.910 (1.89), 6.928 (1.09), 7.147 (0.94), 7.165 (1.54), 7.183 (0.71), 7.302 (1.62), 7.321 (1.48), 7.575 (1.18), 7.594 (1.75), 7.616 (3.91), 7.626 (8.51), 7.631 (4.90), 7.769 (2.16), 7.787 (1.79), 8.075 (0.67), 8.091 (1.40), 8.106 (0.67), 8.160 (0.82), 8.351 (1.65), 8.372 (1.58), 8.522 (5.37), 9.077 (1.61), 9.098 (1.57).
376	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.21 min; MS (ESIpos): m/z = 449 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (1.28), 2.074 (0.92), 2.081 (0.95), 2.090 (1.23), 2.099 (1.37), 2.107 (1.62), 2.115 (1.60), 2.167 (1.52), 2.189 (1.28), 2.328 (0.53), 2.671 (0.49), 4.258 (0.94), 4.276 (2.38), 4.286 (2.24), 4.307 (2.99), 4.317 (2.25), 4.325 (2.52), 4.345 (0.91), 5.311 (1.02), 5.327 (2.32), 5.344 (2.34), 5.361 (1.07), 6.814 (4.66), 6.835 (5.19), 6.877 (2.09), 6.894 (4.48), 6.912 (2.65), 7.163 (2.38), 7.181 (3.70), 7.202 (1.79), 7.253 (3.98), 7.272 (3.65), 7.400 (3.14), 7.405 (3.55), 7.420 (6.02), 7.424 (5.83), 7.457 (5.34), 7.477 (7.81), 7.496 (3.47), 7.718 (5.20), 7.723 (5.42), 7.738 (4.66), 7.742 (4.46), 7.755 (1.40), 7.772 (6.63), 7.781 (7.42), 7.789 (16.00), 7.798 (1.88), 8.164 (3.15), 8.173 (2.91), 8.180 (2.79), 8.188 (2.77), 8.943 (7.32), 8.948 (7.68), 9.208 (4.01), 9.217 (9.88), 9.222 (9.87), 9.228 (4.19).

[1943]

386	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.36 min; MS (ESIpos): m/z = 526 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (1.19), -0.008 (9.91), 0.146 (1.21), 1.523 (9.91), 1.529 (10.20), 1.541 (11.31), 1.552 (14.84), 1.572 (12.60), 2.009 (1.32), 2.018 (1.45), 2.028 (1.53), 2.045 (2.19), 2.052 (1.79), 2.072 (1.11), 2.178 (1.87), 2.190 (1.79), 2.200 (1.69), 2.327 (1.11), 2.366 (1.08), 2.669 (1.16), 2.709 (1.08), 3.848 (1.69), 4.207 (1.05), 4.226 (3.16), 4.234 (2.79), 4.245 (4.93), 4.254 (5.27), 4.270 (2.85), 4.289 (0.90), 5.243 (1.19), 5.258 (2.66), 5.276 (2.74), 5.292 (1.13), 5.753 (6.70), 6.771 (5.67), 6.791 (6.19), 6.895 (2.45), 6.914 (5.22), 6.933 (3.03), 7.141 (2.95), 7.159 (4.56), 7.176 (2.19), 7.327 (2.64), 7.334 (2.87), 7.353 (2.53), 7.465 (3.58), 7.471 (3.85), 7.489 (3.95), 7.495 (3.98), 7.736 (16.00), 7.745 (7.93), 7.752 (7.78), 7.769 (1.27), 7.911 (8.30), 7.918 (8.20), 8.473 (3.87), 8.483 (3.43), 8.489 (3.37), 8.498 (3.51), 8.669 (7.54), 8.679 (8.20), 9.119 (5.19), 9.139 (5.06).
392	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.85 min; MS (ESIpos): m/z = 522 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.44), -0.008 (3.87), 0.008 (3.75), 0.146 (0.44), 1.235 (0.52), 2.012 (0.57), 2.023 (0.75), 2.033 (0.65), 2.046 (1.16), 2.060 (1.08), 2.073 (1.84), 2.135 (0.41), 2.149 (1.12), 2.163 (1.23), 2.181 (0.72), 2.199 (0.67), 2.327 (0.42), 2.366 (0.41), 2.523 (1.29), 2.670 (0.43), 2.710 (0.44), 4.252 (2.47), 4.264 (4.03), 4.278 (2.39), 4.512 (0.46), 4.544 (1.08), 4.577 (2.07), 4.606 (1.41), 4.637 (1.95), 4.647 (2.10), 4.661 (0.77), 4.676 (0.74), 4.691 (0.69), 4.705 (0.72), 4.718 (0.44), 5.178 (0.62), 5.193 (1.42), 5.212 (1.43), 5.226 (0.63), 5.411 (0.80), 5.557 (0.79), 5.754 (4.87), 6.791 (2.68), 6.812 (2.97), 6.894 (1.29), 6.897 (1.35), 6.915 (2.76), 6.931 (1.62), 6.934 (1.63), 7.150 (1.32), 7.154 (1.43), 7.171 (2.22), 7.189 (1.09), 7.192 (1.09), 7.314 (2.35), 7.331 (2.17), 7.472 (1.95), 7.490 (2.54), 7.493 (2.57), 7.511 (2.33), 7.614 (16.00), 7.737 (3.27), 7.753 (2.63), 7.755 (2.75), 8.065 (2.69), 8.084 (2.39), 8.181 (0.62), 8.488 (9.91), 9.045 (2.49), 9.065 (2.43).
393	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.31 min; MS (ESIpos): m/z = 550 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.46), 0.146 (0.50), 2.004 (1.48), 2.054 (1.02), 2.073 (1.42), 2.129 (0.86), 2.179 (1.60), 2.192 (1.83), 2.203 (1.71), 2.214 (1.57), 2.327 (0.49), 2.366 (0.54), 2.669 (0.51), 2.710 (0.49), 3.015 (0.72), 3.192 (1.52), 3.220 (1.63), 3.403 (0.84), 3.429 (1.56), 3.454 (1.45), 4.219 (0.48), 4.240 (1.51), 4.248 (1.25), 4.261 (2.24), 4.270 (2.16), 4.287 (1.32), 4.306 (0.49), 4.909 (0.62), 5.030 (0.63), 5.226 (0.65), 5.241 (1.44), 5.260 (1.43), 5.274 (0.66), 6.787 (2.64), 6.807 (2.91), 6.912 (1.29), 6.931 (2.76), 6.950 (1.60), 7.156 (1.39), 7.174 (2.28), 7.195 (1.06), 7.368 (2.41), 7.386 (2.21), 7.636 (16.00), 7.682 (1.66), 7.701 (2.56), 7.721 (2.23), 7.826 (3.11), 7.844 (2.39), 8.205 (2.59), 8.225 (2.30), 8.680 (8.42), 9.126 (2.54), 9.147 (2.47).
394	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.00 min; MS (ESIpos): m/z = 540 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (3.00), 0.008 (2.42), 2.044 (0.47), 2.054 (0.42), 2.066 (0.71), 2.080 (0.65), 2.169 (0.68), 2.183 (0.74), 2.202 (0.45), 2.219 (0.41), 2.523 (0.83), 4.253 (1.55), 4.266 (2.43), 4.279 (1.48), 4.798 (2.52), 4.830 (5.19), 4.861 (2.27), 5.198 (0.90), 5.217 (0.92), 5.754 (0.78), 6.795 (1.66), 6.815 (1.81), 6.902 (0.81), 6.918 (1.67), 6.937 (0.99), 7.155 (0.84), 7.159 (0.87), 7.176 (1.38), 7.194 (0.66), 7.340 (1.43), 7.359 (1.33), 7.517 (1.16), 7.535 (1.55), 7.538 (1.50), 7.556 (1.38), 7.620 (16.00), 7.779 (1.90), 7.795 (1.64), 8.074 (1.60), 8.093 (1.48), 8.170 (0.52), 8.557 (5.90), 9.136 (1.49), 9.156 (1.43).
396	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.18 min; MS (ESIpos): m/z = 526 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.008 (3.25), 1.618 (0.63), 1.631 (0.69), 1.648 (0.77), 1.909 (0.75), 1.922 (0.75), 1.930 (0.75), 1.943 (0.59), 2.327 (0.50), 2.366 (0.50), 2.669 (0.53), 2.710 (0.51), 3.929 (0.61), 3.951 (1.23), 3.972 (0.85), 4.084 (0.88), 4.094 (0.85), 4.102 (1.06), 4.122 (0.64), 4.979 (0.55), 4.994 (1.22), 5.013 (1.22), 5.028 (0.55), 6.717 (2.55), 6.737 (2.73), 6.787 (5.10), 6.797 (4.07), 7.101 (0.99), 7.113 (1.39), 7.123 (1.52), 7.134 (1.07), 7.144 (0.75), 7.421 (1.35), 7.489 (1.36), 7.580 (1.91), 7.601 (2.47), 7.699 (16.00), 7.717 (2.39), 7.739 (1.49), 7.940 (2.48), 7.956 (2.12), 8.753 (1.33), 8.764 (1.43), 8.806 (1.46), 8.817 (1.31), 8.867 (1.92), 8.888 (1.86), 9.071 (6.62).
397	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.05 min; MS (ESIpos): m/z = 541 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.62), 0.844 (1.37), 0.859 (1.40), 1.235 (0.54), 1.800 (0.44), 2.047 (0.57), 2.523 (1.33), 2.670 (0.42), 4.167 (0.67), 5.116 (0.76), 6.516 (0.46), 6.737 (2.19), 6.757 (2.43), 6.847 (1.09), 6.865 (0.73), 7.118 (1.00), 7.136 (1.73), 7.154 (0.84), 7.465 (0.93), 7.679 (16.00), 7.726 (1.42), 7.747 (2.19), 7.765 (2.16), 7.869 (2.66), 7.890 (1.84), 7.917 (2.54), 7.920 (2.39), 7.934 (2.12), 8.852 (1.93), 8.873 (1.95), 8.981 (6.99).

[1944]

388		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.38 min; MS (ESIpos): m/z = 568 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.48), 0.008 (2.72), 2.032 (0.71), 2.039 (0.77), 2.052 (0.85), 2.067 (1.16), 2.074 (0.99), 2.082 (0.73), 2.181 (0.77), 2.192 (1.2), 2.204 (1.13), 2.214 (1.15), 2.251 (1.94), 2.289 (2.48), 2.322 (1.97), 2.366 (0.45), 3.331 (1.13), 3.348 (2.49), 3.364 (4.98), 3.378 (4.86), 3.393 (2.42), 3.410 (0.88), 4.210 (0.45), 4.217 (0.58), 4.238 (1.67), 4.245 (1.31), 4.259 (1.70), 4.266 (2.15), 4.275 (1.76), 4.281 (1.44), 4.290 (1.42), 4.303 (0.49), 4.309 (0.58), 5.228 (0.69), 5.243 (1.61), 5.262 (1.61), 5.276 (0.71), 6.789 (3.07), 6.810 (3.40), 6.911 (1.52), 6.929 (3.14), 6.948 (1.84), 7.156 (1.45), 7.159 (1.59), 7.176 (2.50), 7.194 (1.18), 7.198 (1.22), 7.367 (2.67), 7.384 (2.44), 7.636 (5.96), 7.639 (16.00), 7.692 (2.00), 7.713 (2.93), 7.731 (2.60), 7.847 (3.64), 7.864 (2.74), 8.262 (3.00), 8.283 (2.65), 8.719 (10.73), 9.173 (2.85), 9.193 (2.80).
404		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.37 min; MS (ESIpos): m/z = 503 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.92), -0.008 (7.44), 0.008 (8.20), 0.146 (0.97), 1.759 (0.46), 1.783 (1.32), 1.806 (1.48), 1.830 (0.56), 2.045 (1.32), 2.071 (2.55), 2.096 (1.99), 2.117 (0.82), 2.179 (1.12), 2.191 (1.17), 2.201 (1.07), 2.270 (0.97), 2.295 (1.43), 2.322 (2.50), 2.327 (2.39), 2.347 (1.43), 2.366 (1.99), 2.523 (4.48), 2.605 (1.22), 2.626 (2.60), 2.650 (2.45), 2.669 (2.29), 2.710 (1.58), 4.221 (0.61), 4.241 (1.89), 4.249 (1.68), 4.260 (2.80), 4.269 (3.26), 4.283 (1.73), 4.301 (0.61), 4.343 (0.41), 4.366 (1.02), 4.387 (1.63), 4.407 (0.97), 5.218 (0.82), 5.233 (1.73), 5.252 (1.78), 5.266 (0.82), 6.781 (3.26), 6.801 (3.62), 6.902 (1.68), 6.921 (3.46), 6.940 (2.09), 7.145 (1.68), 7.149 (1.83), 7.166 (2.75), 7.187 (1.38), 7.342 (2.90), 7.359 (2.70), 7.630 (8.76), 7.635 (16.00), 7.645 (4.54), 7.649 (3.52), 7.654 (1.58), 7.684 (2.39), 7.702 (3.26), 7.705 (3.11), 7.723 (3.11), 7.828 (3.87), 7.831 (4.23), 7.846 (3.16), 7.849 (3.26), 8.185 (3.31), 8.203 (2.96), 8.747 (11.87), 9.091 (3.11), 9.111 (3.01).
406		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.27 min; MS (ESIpos): m/z = 457 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (1.56), 0.008 (1.55), 1.529 (14.85), 1.546 (16.00), 1.555 (15.65), 1.573 (14.94), 2.014 (0.47), 2.030 (1.05), 2.038 (1.09), 2.048 (1.15), 2.056 (1.17), 2.065 (1.65), 2.072 (1.41), 2.080 (1.01), 2.089 (0.68), 2.171 (0.64), 2.181 (1.09), 2.193 (1.44), 2.204 (1.41), 2.214 (1.31), 2.228 (0.85), 2.236 (0.73), 2.248 (0.47), 3.830 (0.61), 3.848 (1.53), 3.866 (2.04), 3.884 (1.51), 3.902 (0.60), 4.211 (0.53), 4.219 (0.74), 4.239 (2.42), 4.247 (2.13), 4.258 (3.89), 4.267 (4.11), 4.282 (2.22), 4.294 (0.55), 4.301 (0.71), 4.310 (0.46), 5.261 (1.00), 5.276 (2.23), 5.296 (2.26), 5.310 (1.00), 6.781 (4.24), 6.801 (4.69), 6.910 (2.06), 6.912 (2.10), 6.928 (4.40), 6.930 (4.40), 6.947 (2.64), 6.949 (2.57), 7.146 (2.14), 7.149 (2.30), 7.167 (3.62), 7.185 (1.70), 7.188 (1.71), 7.348 (3.81), 7.366 (3.51), 7.449 (0.88), 7.454 (1.79), 7.459 (1.26), 7.468 (3.22), 7.473 (6.43), 7.478 (6.93), 7.497 (7.07), 7.516 (3.62), 7.521 (3.95), 7.525 (5.85), 7.529 (3.35), 7.539 (1.50), 7.542 (2.10), 7.547 (1.25), 7.624 (6.23), 7.709 (2.59), 7.726 (4.37), 7.748 (4.22), 7.789 (5.28), 7.791 (5.67), 7.806 (3.43), 7.809 (3.21), 8.415 (3.92), 8.434 (3.66), 8.730 (14.75), 9.099 (3.83), 9.120 (3.74).
407		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.31 min; MS (ESIpos): m/z = 507 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.46), 0.008 (4.67), 0.146 (0.51), 1.530 (14.63), 1.548 (16.00), 1.557 (15.62), 1.575 (14.69), 2.030 (1.04), 2.039 (1.13), 2.056 (1.22), 2.065 (1.66), 2.073 (1.40), 2.081 (1.00), 2.172 (0.67), 2.181 (1.08), 2.193 (1.51), 2.205 (1.40), 2.214 (1.35), 2.229 (0.87), 2.248 (0.49), 2.327 (0.62), 2.366 (0.53), 2.670 (0.66), 2.710 (0.58), 3.830 (0.62), 3.849 (1.53), 3.866 (2.02), 3.885 (1.48), 3.903 (0.58), 4.217 (0.77), 4.237 (2.46), 4.245 (2.06), 4.257 (3.81), 4.266 (3.83), 4.283 (2.19), 4.302 (0.77), 5.262 (1.00), 5.276 (2.28), 5.296 (2.28), 5.310 (1.00), 6.781 (4.30), 6.802 (4.74), 6.912 (2.10), 6.928 (4.43), 6.947 (2.61), 7.147 (2.22), 7.150 (2.30), 7.167 (3.61), 7.185 (1.73), 7.189 (1.71), 7.344 (3.83), 7.362 (3.72), 7.399 (2.33), 7.415 (2.61), 7.478 (0.44), 7.498 (0.67), 7.561 (4.92), 7.579 (1.68), 7.598 (6.14), 7.608 (4.99), 7.615 (10.39), 7.627 (1.57), 7.706 (0.73), 7.720 (3.01), 7.738 (4.46), 7.760 (4.03), 7.815 (5.50), 7.830 (3.57), 8.429 (3.90), 8.448 (3.68), 8.717 (14.67), 9.099 (3.86), 9.120 (3.81).

[1945]

408	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.26 min; MS (ESIpos): m/z = 509 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.533 (14.48), 1.551 (16.00), 1.559 (15.43), 1.577 (14.51), 2.019 (1.10), 2.027 (1.16), 2.037 (1.29), 2.043 (1.30), 2.053 (1.77), 2.061 (1.48), 2.069 (1.06), 2.170 (1.16), 2.182 (1.57), 2.193 (1.49), 2.204 (1.42), 2.216 (0.97), 2.669 (0.41), 3.835 (0.65), 3.852 (1.60), 3.870 (2.11), 3.888 (1.53), 3.906 (0.64), 4.206 (0.81), 4.227 (2.52), 4.234 (2.16), 4.247 (3.95), 4.256 (3.84), 4.273 (2.27), 4.292 (0.78), 5.247 (1.07), 5.261 (2.45), 5.280 (2.43), 5.295 (1.05), 6.773 (4.46), 6.793 (5.02), 6.899 (2.19), 6.917 (4.73), 6.936 (2.74), 7.142 (2.33), 7.161 (3.88), 7.179 (1.81), 7.338 (4.13), 7.357 (3.80), 7.499 (2.10), 7.518 (4.65), 7.538 (2.73), 7.571 (0.56), 7.591 (1.20), 7.610 (0.68), 7.746 (2.26), 7.763 (5.20), 7.774 (3.98), 7.784 (4.83), 7.806 (5.93), 7.826 (3.63), 7.848 (3.46), 7.865 (1.75), 7.910 (0.66), 7.926 (0.75), 7.945 (0.64), 8.492 (3.95), 8.513 (3.73), 8.684 (13.95), 9.126 (4.03), 9.147 (3.92).
409	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.24 min; MS (ESIpos): m/z = 475 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.49), -0.008 (4.30), 0.008 (4.43), 0.146 (0.48), 1.531 (14.92), 1.549 (16.00), 1.558 (15.65), 1.576 (14.94), 2.016 (1.06), 2.025 (1.12), 2.034 (1.15), 2.041 (1.17), 2.051 (1.63), 2.059 (1.41), 2.067 (1.01), 2.163 (0.62), 2.172 (1.08), 2.184 (1.45), 2.196 (1.41), 2.205 (1.30), 2.219 (0.84), 2.226 (0.75), 2.239 (0.48), 2.327 (0.49), 2.366 (0.70), 2.669 (0.59), 2.709 (0.71), 3.828 (0.60), 3.845 (1.48), 3.863 (1.98), 3.881 (1.45), 3.899 (0.57), 4.202 (0.55), 4.210 (0.79), 4.230 (2.42), 4.238 (2.09), 4.249 (3.86), 4.258 (3.99), 4.275 (2.18), 4.286 (0.59), 4.294 (0.75), 4.302 (0.48), 5.250 (0.99), 5.264 (2.18), 5.284 (2.22), 5.298 (0.99), 6.774 (4.12), 6.792 (4.36), 6.795 (4.54), 6.900 (2.03), 6.902 (2.11), 6.919 (4.30), 6.921 (4.32), 6.937 (2.60), 6.940 (2.56), 7.140 (2.12), 7.144 (2.29), 7.161 (3.50), 7.179 (1.70), 7.182 (1.70), 7.309 (2.18), 7.329 (5.82), 7.339 (3.97), 7.348 (4.54), 7.357 (3.62), 7.384 (2.38), 7.388 (2.82), 7.399 (2.69), 7.403 (3.70), 7.418 (1.65), 7.423 (1.54), 7.628 (1.94), 7.633 (2.05), 7.648 (3.06), 7.666 (1.81), 7.670 (1.70), 7.730 (2.00), 7.748 (4.98), 7.768 (6.90), 7.771 (6.96), 7.776 (6.74), 7.788 (2.22), 7.793 (1.39), 8.470 (3.41), 8.475 (3.42), 8.491 (3.33), 8.495 (3.17), 8.692 (14.76), 9.114 (3.73), 9.135 (3.70).
410	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.26 min; MS (ESIpos): m/z = 475 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (3.13), 0.008 (3.29), 0.146 (0.40), 1.528 (14.85), 1.546 (16.00), 1.555 (15.61), 1.573 (15.00), 2.001 (0.49), 2.016 (1.06), 2.025 (1.11), 2.035 (1.18), 2.042 (1.17), 2.052 (1.64), 2.059 (1.39), 2.067 (1.00), 2.163 (0.65), 2.173 (1.07), 2.185 (1.47), 2.197 (1.40), 2.207 (1.31), 2.218 (0.65), 2.327 (0.48), 2.366 (0.42), 2.669 (0.53), 2.709 (0.46), 3.821 (0.64), 3.839 (1.49), 3.857 (1.95), 3.874 (1.44), 3.892 (0.60), 4.202 (0.56), 4.210 (0.78), 4.230 (2.43), 4.238 (2.08), 4.249 (3.91), 4.259 (3.92), 4.275 (2.22), 4.294 (0.76), 5.251 (1.01), 5.265 (2.22), 5.285 (2.26), 5.300 (0.99), 6.774 (4.47), 6.795 (4.89), 6.900 (2.08), 6.903 (2.17), 6.921 (4.49), 6.937 (2.63), 6.940 (2.65), 7.141 (2.17), 7.144 (2.30), 7.162 (3.63), 7.179 (1.71), 7.183 (1.71), 7.323 (3.21), 7.338 (4.16), 7.345 (6.69), 7.355 (3.75), 7.368 (3.97), 7.485 (2.85), 7.492 (4.04), 7.500 (2.96), 7.507 (4.05), 7.515 (2.58), 7.522 (2.10), 7.525 (2.92), 7.533 (1.86), 7.536 (2.35), 7.544 (1.88), 7.547 (2.22), 7.554 (1.51), 7.721 (2.43), 7.739 (4.57), 7.760 (4.71), 7.785 (5.80), 7.799 (2.83), 8.463 (3.64), 8.466 (3.77), 8.484 (3.54), 8.487 (3.37), 8.687 (15.55), 9.113 (3.86), 9.133 (3.75).
411	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.31 min; MS (ESIpos): m/z = 491 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.52), -0.008 (4.69), 0.008 (4.82), 0.146 (0.52), 1.534 (14.70), 1.552 (16.00), 1.560 (15.73), 1.578 (14.85), 2.031 (1.01), 2.039 (1.07), 2.056 (1.17), 2.066 (1.67), 2.074 (1.42), 2.170 (0.64), 2.191 (1.44), 2.203 (1.40), 2.213 (1.34), 2.225 (0.87), 2.328 (0.66), 2.366 (0.78), 2.670 (0.70), 2.710 (0.72), 3.840 (0.62), 3.856 (1.50), 3.874 (2.00), 3.892 (1.50), 3.909 (0.58), 4.216 (0.76), 4.236 (2.41), 4.245 (2.10), 4.256 (3.85), 4.265 (3.95), 4.282 (2.20), 4.300 (0.76), 5.259 (0.97), 5.274 (2.22), 5.293 (2.27), 5.308 (1.01), 6.781 (4.32), 6.801 (4.72), 6.910 (2.06), 6.928 (4.39), 6.945 (2.59), 7.145 (2.20), 7.149 (2.33), 7.167 (3.62), 7.184 (1.71), 7.188 (1.69), 7.347 (3.77), 7.364 (3.48), 7.511 (0.54), 7.694 (1.57), 7.713 (4.35), 7.732 (6.71), 7.750 (4.76), 7.754 (5.35), 7.759 (5.37), 7.771 (4.57), 7.836 (5.46), 7.852 (3.71), 7.874 (3.95), 7.897 (7.35), 8.441 (3.99), 8.461 (3.67), 8.721 (15.16), 9.107 (3.85), 9.128 (3.77).

[1946]

412	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.12 min; MS (ESIpos): m/z = 542 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.146 (0.43), 1.233 (0.49), 1.756 (0.67), 1.768 (0.74), 1.784 (0.78), 2.002 (0.81), 2.015 (0.83), 2.023 (0.78), 2.037 (0.56), 2.327 (0.67), 2.366 (0.58), 2.669 (0.76), 2.709 (0.61), 3.946 (0.74), 3.967 (1.32), 3.988 (0.85), 4.134 (0.94), 4.152 (1.10), 4.171 (0.72), 5.059 (0.65), 5.074 (1.28), 5.093 (1.21), 5.107 (0.54), 6.729 (2.29), 6.749 (2.44), 6.854 (0.94), 6.874 (2.31), 6.892 (1.77), 6.932 (2.42), 6.949 (1.39), 7.094 (5.94), 7.108 (1.79), 7.130 (1.99), 7.147 (1.01), 7.685 (16.00), 7.719 (1.55), 7.738 (2.20), 7.758 (2.11), 7.861 (2.62), 7.880 (1.93), 7.921 (2.62), 7.938 (2.15), 8.272 (1.86), 8.884 (2.29), 8.884 (2.13), 8.993 (6.79).
418	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.23 min; MS (ESIpos): m/z = 475 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.65), 0.008 (1.55), 1.529 (9.91), 1.546 (10.68), 1.556 (11.45), 1.574 (10.97), 2.011 (0.79), 2.019 (0.83), 2.029 (0.86), 2.036 (0.88), 2.046 (1.25), 2.054 (1.05), 2.061 (0.78), 2.070 (0.55), 2.085 (16.00), 2.158 (0.47), 2.167 (0.82), 2.180 (1.09), 2.191 (1.07), 2.201 (0.98), 2.212 (0.63), 2.523 (0.80), 3.816 (0.45), 3.833 (1.04), 3.851 (1.38), 3.869 (1.03), 3.887 (0.42), 4.208 (0.56), 4.228 (1.84), 4.236 (1.62), 4.247 (2.92), 4.255 (3.09), 4.271 (1.69), 4.283 (0.43), 4.290 (0.53), 5.247 (0.74), 5.261 (1.64), 5.281 (1.65), 5.295 (0.75), 6.771 (3.27), 6.791 (3.58), 6.894 (1.53), 6.897 (1.53), 6.913 (3.26), 6.932 (1.99), 6.934 (1.87), 7.137 (1.66), 7.141 (1.75), 7.158 (2.68), 7.175 (1.32), 7.179 (1.28), 7.258 (1.26), 7.279 (1.22), 7.293 (1.89), 7.301 (1.38), 7.315 (2.98), 7.323 (2.78), 7.331 (2.81), 7.336 (2.95), 7.344 (2.35), 7.349 (2.44), 7.577 (1.76), 7.590 (1.90), 7.599 (1.75), 7.612 (1.58), 7.682 (1.73), 7.686 (2.13), 7.700 (4.61), 7.703 (4.23), 7.717 (3.84), 7.738 (3.71), 7.756 (1.81), 8.452 (2.70), 8.456 (2.79), 8.473 (2.60), 8.477 (2.48), 8.660 (9.72), 9.115 (2.91), 9.136 (2.80).
419	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.30 min; MS (ESIpos): m/z = 475 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.50), -0.008 (4.19), 0.008 (4.14), 0.146 (0.48), 1.525 (14.78), 1.543 (16.00), 1.552 (15.64), 1.569 (14.85), 2.030 (1.00), 2.038 (1.03), 2.048 (1.12), 2.055 (1.12), 2.065 (1.63), 2.073 (1.39), 2.081 (1.00), 2.171 (0.65), 2.180 (1.08), 2.192 (1.46), 2.204 (1.39), 2.214 (1.24), 2.228 (0.84), 2.327 (0.79), 2.366 (0.62), 2.669 (0.84), 2.709 (0.67), 3.832 (0.62), 3.848 (1.48), 3.866 (2.03), 3.884 (1.48), 3.902 (0.60), 4.210 (0.55), 4.219 (0.79), 4.239 (2.42), 4.247 (2.06), 4.258 (3.87), 4.267 (3.99), 4.283 (2.18), 4.302 (0.72), 4.311 (0.50), 5.260 (0.96), 5.275 (2.20), 5.294 (2.22), 5.309 (0.98), 6.781 (4.28), 6.802 (4.71), 6.911 (2.01), 6.913 (2.08), 6.932 (4.31), 6.948 (2.63), 6.951 (2.58), 7.147 (2.13), 7.151 (2.32), 7.169 (3.54), 7.186 (1.70), 7.190 (1.75), 7.350 (3.71), 7.368 (3.44), 7.419 (3.16), 7.423 (2.92), 7.444 (3.09), 7.447 (3.04), 7.457 (2.15), 7.462 (3.32), 7.467 (2.25), 7.479 (1.87), 7.484 (3.52), 7.489 (2.87), 7.496 (5.60), 7.500 (7.01), 7.624 (0.55), 7.717 (2.82), 7.735 (4.69), 7.756 (4.26), 7.838 (5.41), 7.854 (3.78), 7.856 (3.73), 8.442 (3.97), 8.461 (3.61), 8.753 (15.50), 9.106 (3.90), 9.126 (3.80).
420	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.27 min; MS (ESIpos): m/z = 525 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (3.45), 0.008 (3.55), 0.146 (0.41), 1.529 (9.38), 1.539 (9.80), 1.547 (11.02), 1.559 (16.00), 1.578 (11.91), 1.581 (11.87), 2.011 (1.20), 2.030 (1.39), 2.039 (1.60), 2.046 (1.79), 2.054 (1.43), 2.085 (5.81), 2.174 (1.52), 2.186 (1.56), 2.196 (1.37), 2.327 (0.68), 2.366 (0.75), 2.669 (0.68), 2.710 (0.73), 3.848 (1.31), 3.865 (1.68), 3.878 (1.31), 4.199 (0.71), 4.219 (1.78), 4.227 (2.57), 4.241 (3.61), 4.250 (4.05), 4.267 (2.68), 4.285 (0.85), 5.257 (2.24), 5.271 (2.20), 5.754 (2.22), 6.767 (5.06), 6.788 (5.62), 6.888 (1.37), 6.892 (1.52), 6.906 (2.91), 6.911 (3.15), 6.925 (1.81), 6.928 (1.89), 7.135 (2.64), 7.155 (4.03), 7.174 (2.05), 7.319 (2.22), 7.337 (4.15), 7.354 (2.18), 7.424 (0.50), 7.440 (0.83), 7.444 (0.87), 7.458 (0.42), 7.475 (0.42), 7.487 (0.77), 7.505 (0.62), 7.609 (0.89), 7.627 (2.80), 7.640 (3.51), 7.646 (3.20), 7.658 (5.83), 7.677 (3.53), 7.680 (3.53), 7.700 (1.81), 7.706 (2.86), 7.709 (3.38), 7.723 (7.68), 7.727 (7.16), 7.736 (5.71), 7.757 (5.40), 7.775 (2.37), 7.894 (0.44), 7.916 (4.48), 7.921 (4.48), 7.935 (3.88), 7.940 (3.80), 8.475 (4.00), 8.479 (4.25), 8.496 (3.88), 8.500 (3.84), 8.649 (8.55), 8.658 (9.36), 9.107 (2.39), 9.126 (3.82), 9.145 (2.35).
421	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.22 min; MS (ESIpos): m/z = 475 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (0.74), 0.008 (0.66), 1.388 (16.00), 1.531 (2.32), 1.549 (2.57), 1.558 (3.55), 1.576 (3.28), 2.044 (0.42), 3.853 (0.41), 4.226 (0.60), 4.235 (0.52), 4.245 (0.96), 4.254 (1.03), 4.270 (0.56), 5.259 (0.53), 5.278 (0.54), 6.770 (1.05), 6.790 (1.17), 6.894 (0.43), 6.913 (0.95), 6.931 (0.55), 7.136 (0.49), 7.139 (0.53), 7.157 (0.86), 7.175 (0.41), 7.178 (0.42), 7.223 (0.50), 7.329 (0.63), 7.348 (0.59), 7.451 (1.08), 7.460 (1.29), 7.472 (1.04), 7.479 (1.04), 7.685 (0.58), 7.688 (0.73), 7.702 (1.46), 7.706 (1.42), 7.723 (1.24), 7.744 (1.24), 7.762 (0.62), 8.461 (0.89), 8.464 (0.98), 8.482 (0.88), 8.485 (0.89), 8.653 (1.41), 9.113 (0.66), 9.133 (0.64).

[1947]

422	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.26 min; MS (ESIpos): m/z = 457 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.40), 0.008 (2.26), 1.141 (0.70), 1.520 (7.81), 1.537 (8.37), 1.547 (8.11), 1.564 (7.79), 2.023 (0.54), 2.031 (0.58), 2.048 (0.63), 2.058 (0.85), 2.066 (0.74), 2.075 (0.59), 2.085 (6.90), 2.161 (16.00), 2.177 (0.76), 2.189 (0.78), 2.201 (0.76), 2.211 (0.70), 2.327 (0.45), 2.386 (0.52), 2.395 (0.44), 2.416 (12.94), 2.416 (12.94), 2.670 (0.45), 3.822 (0.75), 3.841 (1.02), 3.858 (0.72), 4.238 (1.26), 4.246 (1.09), 4.257 (2.03), 4.265 (2.14), 4.282 (1.14), 5.259 (0.50), 5.273 (1.16), 5.293 (1.14), 5.307 (0.53), 5.754 (0.60), 6.710 (3.80), 6.712 (3.83), 6.779 (2.31), 6.799 (2.52), 6.911 (1.13), 6.927 (2.33), 6.946 (1.40), 7.145 (1.16), 7.149 (1.23), 7.167 (1.85), 7.184 (0.91), 7.341 (1.95), 7.359 (1.78), 7.624 (1.06), 7.628 (1.41), 7.642 (3.30), 7.646 (3.02), 7.655 (2.78), 7.676 (2.61), 7.694 (1.18), 8.342 (1.79), 8.346 (1.89), 8.363 (1.74), 8.367 (1.66), 8.686 (8.47), 9.079 (1.98), 9.100 (1.92).
423	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.35 min; MS (ESIpos): m/z = 497 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.141 (0.76), 1.356 (1.34), 1.519 (14.63), 1.537 (16.00), 1.546 (15.53), 1.564 (14.65), 2.023 (1.05), 2.031 (1.09), 2.049 (1.27), 2.058 (1.67), 2.066 (1.49), 2.085 (11.52), 2.183 (1.31), 2.191 (1.53), 2.203 (1.48), 2.212 (1.37), 2.327 (0.60), 2.366 (0.65), 2.670 (0.66), 2.709 (0.66), 3.811 (0.65), 3.829 (1.53), 3.847 (2.05), 3.865 (1.54), 3.881 (0.61), 4.215 (0.80), 4.235 (2.49), 4.243 (2.19), 4.255 (3.96), 4.264 (3.93), 4.281 (2.31), 4.300 (0.76), 5.257 (1.04), 5.273 (2.31), 5.292 (2.38), 5.306 (1.02), 5.754 (1.15), 6.779 (4.42), 6.799 (4.85), 6.912 (2.14), 6.930 (4.56), 6.947 (2.64), 7.149 (2.39), 7.167 (3.78), 7.188 (1.87), 7.231 (13.75), 7.346 (3.92), 7.364 (3.67), 7.716 (2.56), 7.734 (4.37), 7.755 (4.14), 7.800 (5.63), 7.815 (3.43), 8.454 (3.95), 8.473 (3.67), 8.737 (14.24), 9.105 (3.82), 9.125 (3.71).
424	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.83 min; MS (ESIpos): m/z = 492 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.62), 0.146 (0.58), 2.082 (0.85), 2.092 (0.94), 2.118 (1.45), 2.126 (1.23), 2.220 (1.28), 2.232 (1.23), 2.242 (1.10), 2.328 (0.69), 2.366 (0.74), 2.670 (0.75), 2.710 (0.77), 3.046 (2.57), 3.168 (0.82), 3.426 (3.56), 3.443 (4.68), 4.227 (0.88), 4.247 (2.21), 4.256 (1.97), 4.267 (3.31), 4.275 (3.45), 4.292 (1.93), 4.310 (0.72), 5.298 (1.79), 5.314 (1.79), 6.790 (3.71), 6.811 (4.03), 6.913 (1.81), 6.931 (3.79), 6.949 (2.21), 7.158 (1.97), 7.176 (3.10), 7.196 (1.57), 7.376 (3.26), 7.394 (2.97), 7.646 (8.78), 7.650 (16.00), 7.658 (5.74), 7.662 (4.49), 7.772 (1.84), 7.790 (3.18), 7.811 (2.48), 7.898 (4.35), 7.915 (3.20), 8.337 (0.98), 8.400 (2.78), 8.421 (2.49), 8.895 (10.41), 9.594 (1.37).
425	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.26 min; MS (ESIpos): m/z = 475 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.52), 0.008 (1.58), 1.509 (12.78), 1.527 (13.71), 1.536 (13.42), 1.554 (12.80), 2.013 (0.92), 2.022 (1.01), 2.032 (1.08), 2.039 (1.12), 2.049 (1.52), 2.056 (1.44), 2.085 (7.75), 2.172 (0.94), 2.184 (1.30), 2.196 (1.24), 2.206 (1.19), 2.219 (0.80), 2.240 (0.47), 2.327 (0.45), 2.366 (0.47), 2.423 (16.00), 2.669 (0.46), 2.710 (0.40), 3.804 (0.54), 3.823 (1.32), 3.840 (1.76), 3.859 (1.30), 3.876 (0.52), 4.201 (0.51), 4.208 (0.72), 4.228 (2.09), 4.236 (1.71), 4.249 (2.84), 4.259 (2.77), 4.267 (1.88), 4.277 (1.91), 4.288 (0.56), 4.295 (0.68), 4.304 (0.47), 5.246 (0.87), 5.260 (1.95), 5.280 (1.96), 5.294 (0.85), 5.754 (7.58), 6.631 (2.13), 6.777 (3.89), 6.797 (4.26), 6.902 (1.75), 6.904 (1.90), 6.923 (3.94), 6.939 (2.29), 6.942 (2.32), 7.143 (1.85), 7.147 (2.06), 7.164 (3.17), 7.182 (1.50), 7.185 (1.53), 7.334 (3.33), 7.352 (3.03), 7.618 (2.57), 7.641 (4.67), 7.664 (2.68), 8.442 (2.31), 8.457 (2.47), 8.465 (2.46), 8.481 (2.28), 8.709 (12.28), 9.081 (3.16), 9.102 (3.09).
426	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.32 min; MS (ESIpos): m/z = 515 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.83), -0.008 (6.50), 0.008 (7.02), 0.146 (0.83), 1.235 (0.67), 1.508 (14.93), 1.526 (15.98), 1.534 (16.00), 1.552 (15.19), 2.051 (1.31), 2.073 (1.29), 2.085 (2.88), 2.185 (1.50), 2.198 (1.48), 2.207 (1.40), 2.220 (0.98), 2.327 (0.90), 2.366 (0.95), 2.669 (0.93), 2.710 (0.93), 3.828 (1.33), 3.846 (1.74), 3.863 (1.31), 4.206 (0.79), 4.225 (2.29), 4.233 (1.88), 4.252 (2.95), 4.259 (2.71), 4.267 (2.05), 4.276 (2.19), 4.295 (0.83), 5.245 (0.93), 5.259 (2.12), 5.278 (2.17), 5.292 (0.98), 6.776 (4.48), 6.796 (4.88), 6.905 (2.21), 6.924 (4.50), 6.940 (2.71), 7.144 (2.24), 7.147 (2.40), 7.165 (3.71), 7.186 (1.83), 7.205 (3.79), 7.230 (3.98), 7.333 (1.83), 7.346 (2.26), 7.362 (1.69), 7.687 (2.98), 7.710 (5.17), 7.732 (3.05), 8.553 (2.71), 8.568 (2.88), 8.577 (2.88), 8.593 (2.71), 8.764 (7.26), 9.111 (3.05), 9.132 (3.05).
428	LC-MS (L2): Rt = 3.893 min; m/z = 517/5519 (M+H) ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 9.16 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 8.72 (s, 1H), 8.69 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.14 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.71 - 7.66 (m, 3H), 7.37 (d, J = 7.9, 1.7 Hz, 1H), 7.17 (t, J = 8.5, 7.4, 1.7 Hz, 1H), 6.92 (t, J = 7.4, 1.2 Hz, 1H), 6.80 (d, J = 8.3, 1.2 Hz, 1H), 5.23 (q, J = 5.8 Hz, 1H), 4.32 - 4.17 (m, 2H), 3.12 (s, 6H), 2.26 - 2.14 (m, 1H), 2.10 - 1.99 (m, 1H).

[1948]

430	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.23 min; MS (ESIpos): m/z = 459 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.008 (1.38), 1.526 (14.80), 1.543 (16.00), 1.552 (15.65), 1.570 (14.87), 2.029 (1.04), 2.038 (1.12), 2.047 (1.19), 2.055 (1.21), 2.064 (1.68), 2.072 (1.42), 2.080 (1.02), 2.087 (0.71), 2.172 (0.65), 2.181 (1.10), 2.193 (1.48), 2.205 (1.42), 2.215 (1.36), 2.228 (0.86), 3.828 (0.64), 3.845 (1.58), 3.863 (2.07), 3.881 (1.54), 3.899 (0.60), 4.211 (0.56), 4.219 (0.77), 4.239 (2.44), 4.247 (2.13), 4.258 (3.96), 4.267 (4.09), 4.283 (2.26), 4.302 (0.73), 5.262 (1.01), 5.277 (2.33), 5.296 (2.31), 5.311 (1.05), 6.781 (4.65), 6.801 (5.20), 6.912 (2.17), 6.930 (4.68), 6.949 (2.74), 7.150 (2.33), 7.168 (3.75), 7.189 (1.74), 7.252 (1.63), 7.258 (1.26), 7.276 (3.15), 7.282 (3.16), 7.301 (6.35), 7.318 (6.19), 7.334 (1.02), 7.348 (4.05), 7.366 (3.67), 7.716 (2.63), 7.734 (4.12), 7.755 (3.67), 7.834 (5.55), 7.851 (4.00), 8.459 (3.86), 8.459 (3.86), 8.750 (14.88), 9.106 (3.97), 9.126 (3.90).
431	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.37 min; MS (ESIpos): m/z = 525 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.008 (2.75), 1.530 (14.75), 1.548 (16.00), 1.556 (15.84), 1.574 (14.95), 2.034 (1.00), 2.043 (1.11), 2.053 (1.16), 2.059 (1.19), 2.069 (1.70), 2.077 (1.41), 2.085 (1.05), 2.191 (1.50), 2.203 (1.47), 2.213 (1.38), 2.226 (0.88), 2.328 (0.61), 2.366 (0.66), 2.670 (0.63), 2.710 (0.66), 3.843 (0.64), 3.860 (1.58), 3.878 (2.08), 3.896 (1.53), 3.914 (0.61), 4.209 (0.61), 4.217 (0.75), 4.237 (2.49), 4.245 (2.13), 4.257 (3.91), 4.266 (4.02), 4.282 (2.22), 4.301 (0.75), 5.258 (1.02), 5.273 (2.30), 5.292 (2.31), 5.307 (1.03), 6.782 (4.49), 6.802 (4.96), 6.913 (2.21), 6.931 (4.58), 6.950 (2.69), 7.151 (2.39), 7.168 (3.68), 7.190 (1.78), 7.351 (3.93), 7.370 (3.58), 7.740 (2.83), 7.758 (4.07), 7.761 (3.88), 7.779 (3.71), 7.891 (10.85), 7.902 (6.54), 7.909 (5.57), 7.968 (6.30), 8.471 (4.19), 8.492 (3.75), 8.752 (15.12), 9.117 (4.02), 9.138 (3.91).
432	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.93 min; MS (ESIpos): m/z = 506 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.063 (0.44), 2.074 (1.74), 2.085 (0.57), 2.091 (0.49), 2.154 (16.00), 2.213 (0.54), 2.223 (0.51), 2.230 (0.52), 3.994 (3.21), 4.221 (0.41), 4.226 (0.88), 4.232 (0.59), 4.243 (0.65), 4.249 (0.52), 4.271 (0.53), 4.278 (0.67), 4.284 (0.59), 4.291 (0.69), 5.297 (0.75), 5.313 (0.74), 6.792 (1.44), 6.793 (1.49), 6.808 (1.59), 6.810 (1.58), 6.918 (0.74), 6.920 (0.73), 6.933 (1.47), 6.935 (1.43), 6.948 (0.86), 6.950 (0.81), 7.160 (0.72), 7.163 (0.74), 7.177 (1.18), 7.191 (0.60), 7.194 (0.57), 7.404 (1.21), 7.418 (1.15), 7.646 (0.87), 7.655 (9.82), 7.725 (1.04), 7.739 (1.43), 7.741 (1.26), 7.756 (1.25), 7.863 (1.61), 7.866 (1.64), 7.877 (1.33), 7.880 (1.26), 8.164 (1.66), 8.523 (1.33), 8.526 (1.33), 8.540 (1.27), 8.543 (1.20), 8.920 (5.25), 9.432 (1.31), 9.448 (1.27).
438	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.37 min; MS (ESIpos): m/z = 509 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.41), -0.008 (3.62), 0.008 (3.26), 1.356 (1.83), 1.523 (14.77), 1.541 (16.00), 1.550 (15.57), 1.568 (14.88), 2.032 (1.00), 2.041 (1.04), 2.051 (1.14), 2.058 (1.11), 2.067 (1.68), 2.073 (2.66), 2.084 (1.01), 2.170 (0.66), 2.183 (1.20), 2.192 (1.42), 2.203 (1.34), 2.213 (1.30), 2.225 (0.81), 2.323 (0.49), 2.327 (0.62), 2.366 (0.55), 2.523 (1.52), 2.670 (0.68), 2.709 (0.55), 3.833 (0.60), 3.851 (1.50), 3.869 (2.02), 3.887 (1.45), 3.905 (0.60), 4.211 (0.54), 4.219 (0.74), 4.239 (2.40), 4.247 (2.04), 4.258 (3.83), 4.267 (3.95), 4.283 (2.15), 4.301 (0.70), 5.260 (0.98), 5.274 (2.17), 5.294 (2.20), 5.308 (0.96), 5.754 (6.17), 6.780 (4.02), 6.782 (4.25), 6.800 (4.58), 6.803 (4.65), 6.912 (2.09), 6.915 (2.10), 6.931 (4.36), 6.933 (4.28), 6.949 (2.67), 6.952 (2.58), 7.148 (2.17), 7.152 (2.29), 7.169 (3.48), 7.187 (1.71), 7.190 (1.68), 7.351 (3.62), 7.370 (3.40), 7.717 (2.99), 7.735 (4.36), 7.738 (3.68), 7.756 (4.00), 7.786 (15.35), 7.802 (15.29), 7.853 (5.04), 7.855 (5.31), 7.870 (4.03), 7.873 (3.81), 7.907 (0.55), 7.923 (0.54), 8.444 (3.89), 8.464 (3.67), 8.762 (15.95), 9.108 (3.86), 9.129 (3.76).
439	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.10 min; MS (ESIpos): m/z = 560 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.89), 0.008 (3.10), 1.826 (0.43), 2.073 (1.46), 2.086 (0.91), 2.327 (0.43), 2.366 (0.59), 2.670 (0.47), 2.710 (0.59), 4.178 (0.90), 5.127 (1.22), 5.141 (1.19), 6.747 (2.96), 6.767 (3.31), 6.836 (0.98), 6.920 (0.57), 7.045 (0.47), 7.124 (1.50), 7.145 (2.50), 7.162 (1.27), 7.258 (0.57), 7.333 (0.67), 7.467 (0.72), 7.672 (7.22), 7.676 (16.00), 7.682 (6.08), 7.685 (3.72), 7.732 (2.26), 7.750 (2.96), 7.753 (3.13), 7.771 (3.12), 7.911 (3.10), 7.929 (5.80), 7.932 (5.43), 7.946 (3.43), 8.870 (1.48), 8.885 (1.41), 9.005 (5.27), 12.563 (0.65).

[1949]

444	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.30 min; MS (ESIpos): m/z = 489 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (3.30), 0.008 (2.88), 1.528 (9.79), 1.546 (10.48), 1.555 (10.17), 1.573 (9.77), 2.017 (0.68), 2.025 (0.71), 2.035 (0.76), 2.043 (0.78), 2.052 (1.09), 2.060 (0.90), 2.068 (0.66), 2.162 (0.45), 2.171 (0.73), 2.184 (1.01), 2.196 (0.94), 2.205 (0.87), 2.219 (0.57), 2.327 (0.73), 2.346 (16.00), 2.366 (0.80), 2.523 (1.25), 2.665 (0.40), 2.669 (0.54), 2.710 (0.61), 3.841 (0.97), 3.859 (1.27), 3.877 (0.94), 4.211 (0.50), 4.231 (1.58), 4.239 (1.35), 4.250 (2.53), 4.259 (2.64), 4.275 (1.46), 4.294 (0.47), 5.249 (0.64), 5.264 (1.44), 5.283 (1.46), 5.297 (0.61), 6.775 (2.69), 6.793 (2.86), 6.795 (2.95), 6.901 (1.37), 6.904 (1.39), 6.920 (2.83), 6.922 (2.83), 6.938 (1.75), 6.941 (1.70), 7.141 (1.39), 7.145 (1.49), 7.162 (2.34), 7.180 (2.86), 7.183 (2.93), 7.195 (1.84), 7.199 (1.79), 7.340 (2.41), 7.357 (2.27), 7.451 (1.63), 7.455 (1.58), 7.468 (1.65), 7.472 (1.56), 7.716 (1.16), 7.734 (3.42), 7.753 (6.32), 7.756 (5.45), 7.768 (1.30), 8.457 (2.15), 8.462 (2.08), 8.476 (2.08), 8.482 (1.96), 8.687 (9.91), 9.113 (2.57), 9.133 (2.50).
446	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.28 min; MS (ESIpos): m/z = 475 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.006 (0.83), 1.528 (15.59), 1.542 (16.00), 1.554 (15.53), 1.569 (15.22), 2.022 (0.59), 2.029 (0.75), 2.035 (1.20), 2.042 (1.26), 2.049 (1.35), 2.055 (1.35), 2.063 (1.74), 2.069 (1.50), 2.076 (1.05), 2.082 (0.74), 2.178 (0.75), 2.185 (1.16), 2.195 (1.62), 2.205 (1.56), 2.212 (1.50), 2.222 (1.07), 2.229 (0.80), 2.239 (0.53), 3.836 (0.65), 3.851 (1.49), 3.865 (1.95), 3.879 (1.44), 3.893 (0.59), 4.218 (0.74), 4.224 (0.93), 4.240 (2.73), 4.246 (2.13), 4.256 (2.85), 4.261 (3.43), 4.268 (2.78), 4.274 (2.18), 4.281 (2.36), 4.290 (0.72), 4.296 (0.86), 4.303 (0.60), 5.266 (1.16), 5.278 (2.45), 5.293 (2.39), 5.305 (1.07), 5.753 (2.04), 6.783 (4.78), 6.799 (5.11), 6.916 (2.31), 6.931 (4.75), 6.945 (2.64), 7.151 (2.25), 7.154 (2.34), 7.168 (3.85), 7.182 (1.85), 7.184 (1.80), 7.350 (4.06), 7.364 (3.73), 7.492 (2.91), 7.509 (5.77), 7.528 (4.33), 7.571 (2.42), 7.575 (2.60), 7.581 (2.67), 7.585 (2.75), 7.593 (1.86), 7.598 (1.61), 7.602 (1.61), 7.712 (2.90), 7.726 (4.39), 7.743 (3.94), 7.772 (3.91), 7.776 (3.80), 7.786 (3.97), 7.790 (3.76), 7.806 (5.60), 7.819 (3.92), 8.418 (4.24), 8.434 (3.91), 8.736 (14.80), 9.100 (4.07), 9.116 (3.94).
447	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.27 min; MS (ESIpos): m/z = 451 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.67), 0.008 (1.74), 1.531 (11.51), 1.549 (12.60), 1.558 (16.00), 1.576 (15.03), 1.860 (10.28), 1.875 (10.05), 2.011 (1.17), 2.019 (1.28), 2.028 (1.43), 2.035 (1.35), 2.045 (1.78), 2.053 (1.52), 2.061 (1.12), 2.069 (0.78), 2.085 (3.05), 2.168 (3.67), 2.179 (1.64), 2.191 (1.75), 2.201 (1.41), 2.214 (1.00), 2.234 (0.57), 2.285 (12.65), 2.292 (14.54), 2.327 (0.48), 2.669 (0.41), 3.818 (0.64), 3.835 (1.53), 3.853 (2.04), 3.871 (1.49), 3.888 (0.61), 4.199 (0.69), 4.207 (0.86), 4.227 (2.74), 4.235 (2.35), 4.247 (4.38), 4.256 (4.48), 4.272 (2.50), 4.284 (0.69), 4.290 (0.91), 4.299 (0.59), 5.246 (1.09), 5.260 (2.43), 5.280 (2.46), 5.294 (1.09), 5.754 (9.81), 6.772 (4.79), 6.792 (5.26), 6.894 (1.96), 6.912 (4.26), 6.932 (4.96), 6.950 (2.92), 7.005 (0.53), 7.090 (2.60), 7.109 (4.90), 7.141 (3.48), 7.155 (5.80), 7.175 (3.08), 7.303 (0.65), 7.324 (3.77), 7.343 (2.96), 7.412 (0.62), 7.431 (0.77), 7.562 (4.28), 7.565 (4.58), 7.580 (5.85), 7.582 (5.76), 7.673 (4.25), 7.691 (3.82), 7.694 (4.77), 7.712 (3.30), 8.378 (4.53), 8.397 (4.13), 8.616 (12.23), 9.077 (4.12), 9.098 (4.04).
448	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.27 min; MS (ESIpos): m/z = 455 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.15), 0.008 (2.01), 1.526 (8.21), 1.543 (8.67), 1.552 (8.65), 1.570 (8.25), 2.028 (0.57), 2.037 (0.60), 2.047 (0.61), 2.053 (0.63), 2.063 (0.89), 2.071 (0.76), 2.079 (0.53), 2.179 (0.59), 2.192 (0.77), 2.203 (0.76), 2.213 (0.69), 2.227 (0.52), 2.366 (0.49), 2.388 (16.00), 3.842 (0.82), 3.860 (1.10), 3.878 (0.79), 4.239 (1.31), 4.248 (1.14), 4.258 (2.05), 4.267 (2.19), 4.282 (1.16), 5.261 (0.56), 5.276 (1.18), 5.295 (1.18), 5.310 (0.53), 6.778 (2.20), 6.781 (2.35), 6.799 (2.50), 6.801 (2.55), 6.909 (1.16), 6.912 (1.18), 6.928 (2.39), 6.930 (2.36), 6.946 (1.47), 6.949 (1.40), 7.052 (1.36), 7.076 (1.37), 7.146 (1.22), 7.150 (1.28), 7.167 (3.29), 7.190 (2.18), 7.204 (3.78), 7.346 (1.99), 7.365 (1.85), 7.691 (1.43), 7.709 (2.47), 7.731 (2.48), 7.763 (2.94), 7.766 (3.19), 7.781 (1.79), 7.784 (1.62), 8.393 (2.00), 8.396 (2.06), 8.415 (1.96), 8.418 (1.84), 8.721 (8.75), 9.097 (2.09), 9.117 (2.02).

[1950]

<p>449</p>	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 1.27 min, MS (ESIpos): m/z = 477 [M+H]⁺</p>	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.149 (0.44), -0.008 (3.46), 0.008 (3.37), 0.146 (0.41), 1.522 (14.76), 1.540 (16.00), 1.548 (15.61), 1.566 (14.88), 2.014 (0.46), 2.030 (1.02), 2.038 (1.07), 2.048 (1.14), 2.055 (1.14), 2.064 (1.61), 2.072 (1.35), 2.080 (0.98), 2.088 (0.68), 2.171 (0.62), 2.181 (1.07), 2.193 (1.41), 2.205 (1.37), 2.214 (1.27), 2.229 (0.85), 2.235 (0.72), 2.248 (0.46), 2.327 (0.52), 2.366 (0.54), 2.669 (0.59), 2.710 (0.55), 3.826 (0.62), 3.843 (1.51), 3.861 (2.02), 3.879 (1.48), 3.896 (0.57), 4.210 (0.55), 4.218 (0.76), 4.238 (2.44), 4.246 (2.05), 4.258 (3.89), 4.267 (3.93), 4.283 (2.16), 4.295 (0.59), 4.302 (0.73), 5.261 (0.98), 5.276 (2.18), 5.296 (2.20), 5.310 (0.99), 6.782 (4.05), 6.802 (4.47), 6.911 (2.03), 6.914 (2.08), 6.930 (4.31), 6.932 (4.24), 6.948 (2.63), 6.951 (2.50), 7.148 (2.11), 7.152 (2.23), 7.169 (3.50), 7.187 (1.71), 7.190 (1.69), 7.348 (3.67), 7.366 (3.41), 7.538 (4.10), 7.546 (1.25), 7.555 (4.44), 7.561 (4.49), 7.578 (4.34), 7.587 (0.80), 7.594 (0.47), 7.716 (2.81), 7.734 (4.18), 7.737 (3.56), 7.756 (3.90), 7.834 (4.93), 7.836 (5.20), 7.851 (3.82), 8.441 (3.93), 8.460 (3.67), 8.754 (14.49), 9.107 (3.76), 9.128 (3.64).</p>
<p>450</p>	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 1.22 min, MS (ESIpos): m/z = 477 [M+H]⁺</p>	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (3.44), 0.008 (2.25), 1.528 (14.93), 1.546 (16.00), 1.555 (15.22), 1.573 (14.27), 2.003 (0.56), 2.018 (1.14), 2.027 (1.17), 2.036 (1.20), 2.044 (1.21), 2.053 (1.64), 2.061 (1.36), 2.069 (0.97), 2.077 (0.66), 2.165 (0.73), 2.174 (1.14), 2.187 (1.49), 2.198 (1.42), 2.208 (1.32), 2.219 (0.87), 2.229 (0.70), 2.241 (0.45), 2.524 (1.57), 3.824 (0.68), 3.841 (1.51), 3.859 (1.93), 3.877 (1.40), 3.895 (0.55), 4.203 (0.69), 4.210 (0.92), 4.230 (2.57), 4.238 (2.17), 4.250 (3.83), 4.260 (3.63), 4.267 (2.17), 4.276 (2.10), 4.288 (0.60), 4.295 (0.73), 4.304 (0.47), 5.251 (1.07), 5.266 (2.23), 5.285 (2.13), 5.300 (0.94), 6.774 (3.85), 6.776 (3.91), 6.794 (4.27), 6.796 (4.17), 6.902 (2.14), 6.905 (2.10), 6.921 (4.27), 6.923 (4.08), 6.939 (2.56), 6.942 (2.34), 7.142 (2.24), 7.146 (2.30), 7.163 (3.45), 7.181 (1.81), 7.185 (1.77), 7.207 (1.78), 7.215 (1.67), 7.229 (1.65), 7.241 (0.79), 7.340 (3.62), 7.359 (3.30), 7.567 (0.70), 7.575 (0.84), 7.582 (0.97), 7.590 (1.44), 7.595 (1.32), 7.603 (1.42), 7.610 (1.33), 7.616 (1.34), 7.623 (0.84), 7.631 (0.75), 7.639 (0.66), 7.743 (2.63), 7.761 (4.44), 7.782 (4.33), 7.815 (5.04), 7.818 (5.19), 7.832 (3.04), 8.485 (3.72), 8.498 (3.67), 8.516 (3.54), 8.519 (3.18), 8.716 (13.80), 9.126 (3.72), 9.146 (3.50).</p>
<p>451</p>	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 1.32 min, MS (ESIpos): m/z = 505 [M+H]⁺</p>	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.87), 0.008 (2.99), 1.535 (13.93), 1.553 (15.28), 1.562 (16.00), 1.580 (15.01), 2.015 (11.45), 2.043 (1.66), 2.073 (0.70), 2.086 (1.48), 2.156 (0.80), 2.165 (1.28), 2.178 (1.76), 2.190 (1.65), 2.199 (1.57), 2.211 (1.06), 2.220 (0.84), 2.233 (0.55), 2.301 (1.08), 2.327 (0.40), 3.833 (0.67), 3.851 (1.64), 3.868 (2.17), 3.886 (1.60), 3.904 (0.65), 4.194 (0.64), 4.202 (0.82), 4.222 (2.46), 4.230 (2.05), 4.244 (3.50), 4.254 (3.47), 4.261 (2.45), 4.271 (2.47), 4.282 (0.76), 4.289 (0.90), 4.298 (0.61), 5.241 (1.14), 5.256 (2.55), 5.275 (2.57), 5.290 (1.14), 5.754 (11.28), 6.769 (4.42), 6.771 (4.75), 6.789 (5.07), 6.792 (5.21), 6.890 (2.32), 6.892 (2.35), 6.909 (4.87), 6.911 (4.82), 6.927 (2.95), 6.930 (2.82), 7.136 (2.44), 7.140 (2.63), 7.157 (4.04), 7.175 (2.01), 7.178 (1.96), 7.323 (4.16), 7.341 (3.86), 7.398 (0.50), 7.402 (0.46), 7.439 (2.71), 7.483 (0.53), 7.535 (2.86), 7.555 (3.81), 7.665 (5.56), 7.668 (4.53), 7.683 (8.94), 7.719 (5.14), 7.737 (3.59), 7.741 (5.33), 7.758 (3.09), 8.445 (4.24), 8.448 (4.48), 8.467 (4.12), 8.469 (3.99), 8.640 (15.04), 9.087 (2.78), 9.107 (2.71).</p>
<p>453</p>	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 1.29 min, MS (ESIpos): m/z = 491 [M+H]⁺</p>	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (2.92), 0.008 (2.81), 1.528 (13.71), 1.546 (14.79), 1.555 (16.00), 1.573 (15.23), 1.995 (0.48), 2.011 (1.10), 2.019 (1.19), 2.029 (1.25), 2.037 (1.25), 2.046 (1.76), 2.054 (1.47), 2.062 (1.08), 2.158 (0.66), 2.167 (1.14), 2.179 (1.56), 2.191 (1.52), 2.201 (1.38), 2.215 (0.95), 2.224 (0.79), 2.234 (0.51), 2.327 (0.53), 2.366 (0.64), 2.522 (1.30), 2.669 (0.57), 2.710 (0.64), 3.818 (0.59), 3.836 (1.47), 3.854 (1.91), 3.871 (1.43), 3.889 (0.57), 4.199 (0.57), 4.207 (0.81), 4.227 (2.55), 4.235 (2.24), 4.246 (4.18), 4.255 (4.37), 4.271 (2.40), 4.283 (0.66), 4.290 (0.79), 4.299 (0.51), 5.245 (1.03), 5.259 (2.33), 5.279 (2.42), 5.294 (1.12), 6.771 (4.44), 6.792 (4.88), 6.895 (2.11), 6.897 (2.18), 6.916 (4.53), 6.916 (4.55), 6.932 (2.84), 6.934 (2.70), 7.137 (2.24), 7.141 (2.42), 7.158 (3.78), 7.176 (1.82), 7.179 (1.82), 7.331 (3.49), 7.349 (3.32), 7.446 (2.55), 7.457 (3.58), 7.470 (1.80), 7.478 (1.08), 7.484 (1.54), 7.489 (1.34), 7.495 (1.12), 7.505 (4.07), 7.511 (3.08), 7.526 (6.37), 7.533 (5.60), 7.585 (4.48), 7.599 (1.47), 7.607 (2.68), 7.622 (0.88), 7.693 (1.47), 7.698 (2.37), 7.711 (6.81), 7.716 (6.90), 7.719 (7.23), 7.739 (5.49), 7.757 (2.24), 8.456 (3.58), 8.460 (3.76), 8.476 (3.45), 8.480 (3.43), 8.661 (11.47), 8.729 (0.46), 9.113 (4.07), 9.134 (4.00).</p>

[1951]

454	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.13 min; MS (ESIpos): m/z = 515 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm]: 13.33 (br.s, 1H), 8.92 (s, 1H), 8.75 (d, 1H), 8.12-7.96 (m, 2H), 7.90 (dd, 1H), 7.73-7.66 (m, 5H), 7.12 (t, 1H), 6.92 (d, 1H), 6.83 (t, 1H), 6.73 (dd, 1H), 5.12-5.06 (m, 1H), 4.18-4.07 (m, 1H), 3.99 (ddd, 1H), 2.56-2.52 (m, 1H), 2.09-1.96 (m, 1H), 1.78 (td, 1H)
455	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.36 min; MS (ESIpos): m/z = 509 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm]: -0.008 (3.81), 0.008 (2.57), 0.853 (0.46), 1.235 (2.17), 1.300 (0.52), 1.316 (0.51), 1.398 (1.60), 1.513 (14.80), 1.531 (16.00), 1.540 (15.55), 1.558 (14.28), 2.016 (1.21), 2.023 (1.32), 2.033 (1.33), 2.040 (1.33), 2.050 (1.72), 2.057 (1.47), 2.181 (1.67), 2.194 (1.60), 2.203 (1.49), 2.216 (1.01), 2.327 (0.52), 2.669 (0.63), 2.710 (0.49), 3.829 (0.77), 3.847 (1.66), 3.865 (2.13), 3.892 (1.55), 3.900 (0.64), 4.205 (1.06), 4.225 (2.72), 4.233 (2.29), 4.246 (3.46), 4.265 (2.32), 4.274 (2.31), 4.293 (0.84), 5.242 (1.17), 5.256 (2.44), 5.276 (2.34), 5.290 (1.06), 5.754 (5.78), 6.776 (4.38), 6.795 (4.71), 6.900 (2.25), 6.919 (4.51), 6.937 (2.66), 7.146 (2.46), 7.164 (3.72), 7.181 (1.83), 7.335 (3.97), 7.353 (3.56), 7.505 (11.79), 7.509 (11.98), 7.682 (3.19), 7.692 (4.34), 7.697 (7.04), 7.702 (5.43), 7.705 (5.86), 7.728 (2.85), 8.525 (2.64), 8.540 (2.80), 8.549 (2.69), 8.564 (2.43), 8.745 (13.37), 9.099 (3.97), 9.120 (3.77)
477	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.26 min; MS (ESIpos): m/z = 509 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm]: 0.837 (0.43), 0.854 (0.54), 0.881 (0.49), 1.141 (0.54), 1.235 (1.16), 1.317 (0.60), 1.343 (0.69), 1.359 (1.03), 1.519 (11.49), 1.522 (11.46), 1.536 (12.92), 1.541 (13.45), 1.548 (16.00), 1.566 (14.61), 2.000 (1.38), 2.008 (1.47), 2.024 (1.68), 2.035 (2.05), 2.174 (1.95), 2.186 (1.92), 2.196 (1.86), 2.210 (1.48), 2.328 (0.62), 2.366 (0.58), 2.669 (0.65), 2.710 (0.54), 3.849 (1.72), 3.858 (1.72), 4.196 (1.05), 4.216 (3.08), 4.224 (2.77), 4.240 (4.11), 4.265 (2.93), 4.284 (1.16), 5.232 (1.14), 5.247 (2.57), 5.264 (2.59), 6.767 (4.85), 6.787 (5.50), 6.888 (2.50), 6.906 (5.25), 6.924 (3.19), 7.137 (2.79), 7.155 (4.52), 7.172 (2.28), 7.316 (2.70), 7.326 (2.95), 7.333 (2.84), 7.343 (2.62), 7.358 (2.21), 7.361 (2.23), 7.380 (4.65), 7.399 (3.04), 7.403 (2.97), 7.457 (2.43), 7.469 (2.86), 7.477 (4.20), 7.489 (4.31), 7.496 (2.32), 7.508 (2.35), 7.694 (3.04), 7.717 (5.27), 7.739 (7.60), 7.756 (4.31), 7.762 (4.11), 8.555 (2.91), 8.570 (3.22), 8.579 (3.15), 8.594 (2.82), 8.675 (6.93), 8.686 (7.13), 9.115 (4.16), 9.135 (3.98)
478	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.31 min; MS (ESIpos): m/z = 475 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm]: -0.008 (1.30), 0.008 (1.39), 1.157 (0.78), 1.175 (1.56), 1.192 (0.80), 1.398 (0.65), 1.988 (3.13), 2.002 (0.44), 2.012 (0.46), 2.019 (0.47), 2.029 (0.65), 2.036 (0.56), 2.044 (0.40), 2.086 (1.10), 2.135 (0.42), 2.148 (0.61), 2.160 (0.56), 2.169 (0.53), 4.021 (0.69), 4.038 (0.69), 4.216 (0.98), 4.223 (0.77), 4.236 (1.07), 4.243 (1.18), 4.250 (1.04), 4.257 (0.80), 4.266 (0.84), 5.227 (0.88), 5.247 (0.89), 5.677 (1.55), 5.681 (1.65), 5.722 (1.60), 5.725 (1.76), 5.754 (2.74), 5.810 (1.65), 5.813 (1.59), 5.839 (1.68), 5.842 (1.68), 6.775 (1.68), 6.796 (1.85), 6.899 (0.83), 6.917 (1.72), 6.934 (1.01), 7.142 (0.82), 7.146 (0.88), 7.163 (1.40), 7.180 (0.67), 7.184 (0.68), 7.305 (1.47), 7.324 (1.41), 7.331 (1.46), 7.360 (1.32), 7.376 (1.31), 7.405 (1.17), 7.664 (16.00), 7.741 (1.18), 7.759 (1.71), 7.780 (1.56), 7.895 (1.87), 7.898 (2.02), 7.913 (1.52), 7.916 (1.50), 8.242 (1.70), 8.245 (1.76), 8.262 (1.59), 8.266 (1.54), 8.909 (5.42), 9.001 (1.53), 9.021 (1.46)
479	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.29 min; MS (ESIpos): m/z = 525 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm]: 1.519 (14.64), 1.536 (16.00), 1.545 (15.88), 1.563 (14.91), 2.013 (1.08), 2.021 (1.17), 2.031 (1.28), 2.038 (1.29), 2.048 (1.72), 2.055 (1.49), 2.063 (1.07), 2.071 (0.76), 2.161 (0.68), 2.170 (1.10), 2.182 (1.58), 2.194 (1.51), 2.203 (1.44), 2.216 (1.01), 2.237 (0.51), 3.827 (0.66), 3.845 (1.63), 3.863 (2.19), 3.881 (1.61), 3.898 (0.66), 4.196 (0.63), 4.203 (0.84), 4.223 (2.53), 4.230 (2.07), 4.249 (3.21), 4.256 (2.97), 4.264 (2.19), 4.273 (2.28), 4.284 (0.71), 4.292 (0.84), 4.300 (0.57), 5.244 (1.06), 5.258 (2.41), 5.277 (2.44), 5.292 (1.07), 6.774 (4.57), 6.795 (5.08), 6.898 (2.22), 6.916 (4.75), 6.935 (2.76), 7.143 (2.39), 7.162 (3.67), 7.182 (1.81), 7.329 (4.15), 7.348 (3.78), 7.421 (5.41), 7.454 (3.25), 7.466 (3.77), 7.486 (4.52), 7.607 (4.06), 7.627 (6.11), 7.646 (2.60), 7.677 (2.67), 7.700 (5.22), 7.723 (2.75), 8.510 (2.55), 8.525 (2.75), 8.534 (2.70), 8.549 (2.46), 8.707 (13.60), 9.091 (4.09), 9.111 (3.99)

[1952]

487	<p>LC-MS (方法 L12): Rt = 1.56 min; MS (ES pos): m/z = 495 [M+H]⁺</p>	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.150 (0.50), 0.146 (0.45), 0.852 (0.69), 1.234 (3.42), 1.299 (0.54), 1.518 (13.51), 1.536 (14.79), 1.544 (16.00), 1.562 (14.83), 2.006 (1.08), 2.014 (1.24), 2.023 (1.45), 2.031 (1.35), 2.040 (1.61), 2.049 (1.65), 2.056 (1.35), 2.182 (1.69), 2.194 (1.63), 2.203 (1.56), 2.217 (1.13), 2.327 (0.52), 2.669 (0.48), 3.839 (1.13), 3.857 (1.54), 3.866 (1.54), 3.866 (1.08), 4.197 (0.78), 4.223 (2.32), 4.246 (3.38), 4.255 (2.97), 4.263 (2.34), 4.272 (2.41), 4.291 (0.93), 5.256 (2.25), 5.270 (2.26), 6.773 (4.60), 6.793 (5.14), 6.897 (2.13), 6.916 (4.58), 6.934 (2.71), 7.144 (2.47), 7.162 (4.06), 7.180 (1.89), 7.279 (1.78), 7.323 (2.19), 7.342 (4.10), 7.360 (2.08), 7.638 (0.65), 7.646 (0.80), 7.661 (1.58), 7.674 (1.60), 7.687 (1.61), 7.702 (0.89), 7.710 (0.84), 7.724 (2.62), 7.747 (4.86), 7.770 (2.69), 8.596 (2.77), 8.611 (2.95), 8.620 (2.95), 8.635 (2.69), 8.736 (6.87), 8.747 (7.18), 9.121 (4.19), 9.142 (4.12).</p>
488	<p>LC-MS (方法 L12): Rt = 1.60 min; MS (ES pos): m/z = 509 [M+H]⁺</p>	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.149 (0.83), -0.008 (6.41), 0.008 (6.73), 0.146 (0.80), 1.141 (0.40), 1.157 (0.99), 1.175 (1.92), 1.193 (0.96), 1.235 (0.88), 1.398 (2.11), 1.522 (14.80), 1.540 (16.00), 1.548 (15.71), 1.566 (14.90), 1.988 (3.66), 2.013 (1.04), 2.022 (1.15), 2.031 (1.20), 2.048 (1.63), 2.056 (1.39), 2.180 (1.52), 2.192 (1.44), 2.202 (1.39), 2.215 (0.91), 2.327 (0.75), 2.670 (0.83), 3.836 (0.59), 3.853 (1.50), 3.871 (2.03), 3.889 (1.44), 3.907 (0.59), 4.021 (0.83), 4.038 (0.83), 4.202 (0.85), 4.222 (2.51), 4.230 (1.98), 4.248 (2.86), 4.255 (2.80), 4.263 (2.06), 4.272 (2.16), 4.291 (0.88), 5.240 (0.99), 5.255 (2.16), 5.275 (2.22), 5.290 (1.04), 6.774 (4.51), 6.795 (4.99), 6.895 (2.11), 6.897 (2.19), 6.916 (4.43), 6.932 (2.70), 6.935 (2.62), 7.140 (2.22), 7.143 (2.32), 7.161 (3.58), 7.178 (1.82), 7.182 (1.84), 7.330 (3.69), 7.348 (3.42), 7.691 (2.96), 7.714 (6.17), 7.737 (5.96), 7.752 (11.25), 7.767 (7.93), 7.802 (3.53), 7.817 (2.03), 8.524 (2.59), 8.538 (2.78), 8.547 (2.83), 8.563 (2.59), 8.710 (15.17), 9.096 (3.79), 9.117 (3.69).</p>
489	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 1.38 min; MS (ES pos): m/z = 531 [M+H]⁺</p>	<p>¹H-NMR (600 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 1.670 (0.68), 1.681 (1.19), 1.688 (1.28), 1.692 (1.29), 1.700 (1.35), 1.704 (1.28), 1.710 (0.81), 1.938 (0.60), 1.946 (0.88), 1.952 (1.34), 1.960 (1.43), 1.966 (1.42), 1.975 (1.17), 1.980 (0.77), 1.983 (0.76), 1.988 (0.57), 3.957 (1.00), 3.961 (1.18), 3.975 (2.40), 3.989 (1.44), 3.993 (1.28), 4.105 (1.24), 4.110 (1.53), 4.116 (1.46), 4.122 (2.04), 4.128 (1.21), 4.135 (1.18), 4.139 (1.00), 5.034 (0.99), 5.044 (2.14), 5.057 (2.17), 5.067 (0.99), 5.747 (5.67), 6.713 (4.06), 6.726 (4.34), 6.811 (1.78), 6.823 (4.08), 6.835 (2.55), 6.899 (3.76), 6.912 (2.80), 7.101 (1.95), 7.113 (3.41), 7.126 (1.67), 7.259 (4.11), 7.267 (4.21), 7.669 (9.16), 7.672 (9.94), 7.681 (16.00), 7.684 (12.40), 7.691 (2.86), 7.705 (4.02), 7.717 (3.37), 7.795 (5.01), 7.798 (4.25), 7.803 (4.06), 7.806 (6.59), 7.892 (4.03), 7.894 (4.31), 7.904 (3.65), 7.906 (3.78), 8.700 (3.70), 8.714 (3.63), 8.975 (11.32).</p>
493	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 1.07 min; MS (ES pos): m/z = 494 [M+H]⁺</p>	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.008 (1.23), 0.008 (1.23), 1.235 (0.64), 2.073 (0.59), 3.063 (16.00), 3.283 (0.84), 3.332 (1.24), 3.707 (0.83), 3.726 (0.96), 3.735 (0.87), 3.754 (0.75), 5.790 (0.75), 5.810 (0.75), 7.121 (0.41), 7.124 (0.46), 7.140 (0.96), 7.143 (1.04), 7.158 (0.66), 7.161 (0.71), 7.229 (0.45), 7.248 (1.01), 7.266 (0.67), 7.288 (1.37), 7.306 (0.61), 7.389 (1.07), 7.408 (0.94), 7.640 (7.94), 7.651 (2.13), 7.655 (2.38), 7.673 (1.13), 7.798 (1.17), 7.801 (1.35), 7.816 (1.24), 7.819 (1.23), 8.233 (0.99), 8.236 (1.09), 8.254 (0.96), 8.258 (0.98), 8.581 (0.48), 8.683 (3.65), 9.242 (0.98), 9.263 (0.98).</p>
494	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 1.44 min; MS (ES pos): m/z = 517 [M+H]⁺</p>	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.008 (2.50), 1.234 (1.19), 1.797 (2.72), 1.813 (2.16), 1.831 (1.22), 2.017 (3.78), 2.027 (5.23), 2.042 (4.61), 2.052 (4.11), 2.118 (2.71), 2.141 (2.97), 2.166 (2.48), 2.174 (2.13), 2.187 (2.12), 2.198 (1.81), 2.209 (1.47), 2.242 (0.49), 3.802 (1.35), 3.825 (1.96), 3.849 (1.31), 4.211 (0.45), 4.219 (0.64), 4.238 (2.26), 4.247 (2.23), 4.257 (3.32), 4.265 (3.75), 4.279 (2.16), 4.297 (0.65), 4.306 (0.41), 5.268 (0.94), 5.283 (2.12), 5.303 (2.15), 5.317 (0.95), 5.754 (0.50), 6.760 (3.97), 6.800 (4.42), 6.906 (1.93), 6.924 (4.12), 6.943 (2.41), 7.146 (1.92), 7.150 (2.10), 7.167 (3.36), 7.185 (1.57), 7.188 (1.61), 7.334 (3.58), 7.352 (3.29), 7.615 (11.95), 7.620 (16.00), 7.643 (3.83), 7.648 (5.15), 7.652 (2.49), 7.709 (2.30), 7.728 (3.62), 7.749 (3.21), 7.835 (4.99), 7.853 (3.64), 8.277 (3.63), 8.297 (3.29), 8.751 (13.22), 9.097 (3.72), 9.117 (3.65).</p>

[1953]

519	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.91 min; MS (ESIpos): m/z = 518 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.157 (2.50), 1.175 (5.02), 1.193 (2.67), 1.234 (1.23), 1.540 (3.03), 1.988 (9.10), 2.063 (2.50), 2.079 (2.80), 2.198 (2.93), 2.221 (2.26), 2.328 (0.95), 2.366 (0.77), 2.670 (0.84), 2.694 (0.44), 2.710 (0.45), 2.961 (1.24), 2.963 (1.72), 3.003 (1.27), 3.192 (2.79), 3.209 (2.69), 3.510 (0.78), 3.568 (1.00), 3.687 (1.02), 3.944 (1.29), 3.964 (1.72), 3.984 (1.23), 4.003 (1.27), 4.020 (2.57), 4.038 (2.55), 4.056 (1.22), 4.264 (6.12), 5.271 (1.44), 5.287 (3.19), 5.305 (3.16), 5.320 (1.42), 6.779 (5.67), 6.799 (6.10), 6.907 (2.67), 6.926 (5.43), 6.944 (3.19), 7.147 (3.24), 7.166 (5.08), 7.185 (2.43), 7.345 (4.52), 7.364 (4.26), 7.621 (16.00), 7.641 (6.46), 7.646 (7.29), 7.666 (3.01), 7.691 (2.20), 7.711 (3.99), 7.731 (3.09), 7.832 (6.29), 7.849 (4.99), 7.890 (0.71), 7.908 (0.56), 8.417 (0.70), 8.654 (2.62), 8.675 (2.44), 8.759 (14.38), 8.912 (1.06), 9.129 (2.46), 9.139 (2.89), 9.149 (2.97), 9.159 (2.67).
520	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.26 min; MS (ESIpos): m/z = 565 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.735 (0.54), 1.741 (0.60), 1.753 (0.64), 1.769 (0.75), 1.775 (0.68), 1.785 (0.45), 1.982 (0.46), 1.994 (0.70), 2.008 (0.73), 2.016 (0.72), 2.029 (0.56), 3.944 (0.51), 3.950 (0.61), 3.972 (1.26), 3.993 (0.80), 3.999 (0.65), 4.118 (0.63), 4.125 (0.83), 4.134 (0.77), 4.142 (0.98), 4.153 (0.60), 4.162 (0.60), 4.169 (0.47), 5.070 (0.51), 5.084 (1.14), 5.104 (1.15), 5.118 (0.50), 5.754 (1.74), 6.728 (2.15), 6.748 (2.40), 6.803 (0.98), 6.822 (2.24), 6.840 (1.42), 6.951 (2.12), 6.969 (1.59), 7.106 (1.04), 7.127 (1.79), 7.145 (0.87), 7.684 (16.00), 7.737 (1.24), 7.757 (2.35), 7.776 (1.77), 7.862 (1.30), 7.929 (2.60), 7.940 (3.02), 7.943 (2.91), 7.961 (2.06), 8.010 (7.93), 8.156 (1.16), 8.519 (6.04), 8.866 (2.07), 8.886 (2.02), 8.999 (6.20).
539	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.28 min; MS (ESIpos): m/z = 533 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.008 (2.51), 1.235 (0.43), 1.676 (1.54), 1.713 (2.60), 1.751 (1.67), 2.057 (0.97), 2.072 (1.11), 2.085 (1.87), 2.218 (1.33), 2.231 (1.31), 2.240 (1.26), 2.252 (0.92), 2.327 (0.56), 2.366 (0.60), 2.429 (2.14), 2.460 (2.25), 2.670 (0.99), 2.710 (0.67), 3.464 (1.07), 3.493 (1.97), 3.520 (2.14), 3.546 (2.15), 3.575 (1.18), 3.738 (1.26), 4.010 (3.17), 4.023 (2.81), 4.038 (2.85), 4.219 (0.82), 4.240 (2.21), 4.247 (1.78), 4.260 (2.15), 4.268 (2.70), 4.279 (2.21), 4.295 (1.97), 5.293 (0.94), 5.307 (2.08), 5.327 (2.08), 5.342 (0.90), 5.754 (5.00), 6.785 (3.97), 6.804 (4.38), 6.918 (1.97), 6.937 (4.07), 6.956 (2.40), 7.158 (2.10), 7.176 (3.37), 7.193 (1.61), 7.405 (3.52), 7.423 (3.20), 7.613 (13.15), 7.617 (16.00), 7.648 (4.20), 7.653 (5.68), 7.748 (2.29), 7.766 (3.65), 7.787 (3.20), 7.856 (4.95), 7.874 (3.52), 8.510 (3.43), 8.531 (3.17), 8.777 (12.63), 9.140 (3.54), 9.161 (3.54).
552	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.16 min; MS (ESIpos): m/z = 463 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.006 (2.45), 2.035 (0.75), 2.042 (0.79), 2.050 (0.83), 2.056 (0.84), 2.063 (1.08), 2.070 (0.92), 2.076 (0.65), 2.084 (0.55), 2.177 (0.48), 2.184 (0.73), 2.194 (0.96), 2.204 (0.93), 2.212 (0.89), 2.222 (0.61), 2.361 (0.44), 2.635 (0.42), 2.784 (16.00), 4.218 (0.41), 4.240 (1.35), 4.253 (2.26), 4.260 (2.33), 4.273 (1.44), 4.289 (0.47), 5.276 (0.62), 5.288 (1.38), 5.303 (1.35), 5.315 (0.58), 5.753 (1.80), 6.779 (2.82), 6.795 (3.02), 6.899 (1.36), 6.913 (2.78), 6.928 (1.56), 7.147 (1.37), 7.161 (2.32), 7.175 (1.13), 7.336 (2.58), 7.342 (1.47), 7.351 (3.50), 7.367 (1.58), 7.434 (1.15), 7.440 (1.23), 7.440 (1.98), 7.456 (2.00), 7.465 (1.00), 7.471 (0.96), 7.688 (2.97), 7.701 (2.98), 7.714 (4.43), 7.727 (3.55), 7.729 (3.39), 7.757 (2.79), 7.773 (3.09), 7.788 (1.77), 8.296 (2.65), 8.299 (2.73), 8.313 (2.51), 8.315 (2.43), 8.725 (3.78), 8.730 (3.80), 9.066 (1.31), 9.073 (1.41), 9.083 (1.35), 9.089 (1.27).
554	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.11 min; MS (ESIpos): m/z = 449 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.040 (0.54), 2.049 (0.56), 2.058 (0.59), 2.066 (0.62), 2.075 (0.86), 2.084 (0.82), 2.199 (0.74), 2.211 (0.72), 2.221 (0.67), 2.791 (16.00), 4.239 (1.25), 4.248 (1.18), 4.258 (1.91), 4.266 (2.10), 4.281 (1.17), 5.278 (0.52), 5.292 (1.15), 5.311 (1.17), 5.326 (0.53), 5.754 (2.08), 6.782 (2.11), 6.802 (2.36), 6.902 (1.03), 6.921 (2.23), 6.939 (1.30), 7.149 (1.12), 7.167 (1.84), 7.184 (0.89), 7.228 (0.92), 7.240 (0.93), 7.250 (0.92), 7.346 (1.97), 7.365 (1.80), 7.584 (0.41), 7.599 (0.74), 7.612 (0.76), 7.624 (0.74), 7.639 (0.41), 7.779 (1.17), 7.798 (2.28), 7.818 (2.13), 7.853 (2.63), 7.868 (1.51), 8.336 (2.03), 8.339 (2.04), 8.357 (1.93), 8.795 (6.37), 9.088 (1.87), 9.109 (1.81).

[1954]

555	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.11 min; MS (ESIpos): m/z = 504 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (0.81), 0.008 (0.91), 1.235 (0.83), 1.563 (5.80), 1.773 (0.41), 1.790 (0.55), 1.800 (0.64), 2.756 (0.59), 2.782 (0.54), 2.812 (0.68), 2.820 (0.83), 2.977 (16.00), 7.042 (0.46), 7.061 (1.18), 7.070 (0.71), 7.072 (0.72), 7.087 (0.98), 7.090 (1.00), 7.106 (0.45), 7.109 (0.43), 7.131 (0.52), 7.150 (0.77), 7.502 (1.01), 7.520 (0.90), 7.610 (0.79), 7.628 (1.21), 7.632 (1.38), 7.638 (10.75), 7.649 (1.14), 7.771 (1.14), 7.774 (1.26), 7.789 (0.96), 7.792 (0.96), 8.202 (1.03), 8.205 (1.09), 8.223 (0.99), 8.227 (0.96), 8.645 (3.75), 8.744 (1.76).
562	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.74 min; MS (ESIpos): m/z = 533 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.58), -0.008 (5.47), 0.008 (4.38), 0.146 (0.61), 1.235 (1.34), 2.036 (1.59), 2.073 (0.95), 2.159 (1.17), 2.172 (1.51), 2.183 (1.48), 2.193 (1.40), 2.327 (1.17), 2.366 (0.64), 2.523 (2.77), 2.670 (1.31), 2.710 (0.67), 3.996 (0.51), 4.032 (9.72), 4.078 (0.42), 4.203 (0.70), 4.243 (3.57), 4.252 (4.02), 4.267 (2.26), 4.285 (0.76), 4.941 (4.22), 4.966 (2.98), 5.213 (0.97), 5.228 (2.18), 5.247 (2.17), 5.261 (0.90), 5.754 (8.48), 6.780 (4.08), 6.800 (4.58), 6.885 (1.79), 6.903 (3.77), 6.922 (2.20), 7.146 (2.20), 7.164 (3.60), 7.182 (1.68), 7.304 (3.88), 7.322 (3.85), 7.353 (2.26), 7.415 (1.60), 7.427 (2.01), 7.435 (2.80), 7.447 (3.08), 7.454 (1.54), 7.466 (1.53), 7.649 (1.29), 7.666 (5.30), 7.676 (5.97), 7.684 (13.71), 7.689 (6.43), 7.705 (4.35), 7.709 (4.08), 8.136 (4.77), 8.308 (0.72), 8.317 (3.74), 8.325 (3.26), 8.334 (3.46), 8.342 (3.29), 8.630 (16.00), 8.707 (5.45), 9.196 (1.74), 9.214 (2.90), 9.233 (1.90).
563	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.85 min; MS (ESIpos): m/z = 567 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (1.20), -0.008 (9.34), 0.008 (9.02), 0.146 (1.08), 0.854 (0.58), 1.148 (0.41), 1.235 (3.04), 2.039 (1.61), 2.085 (3.50), 2.183 (1.52), 2.194 (1.37), 2.327 (1.81), 2.366 (0.93), 2.669 (2.04), 2.709 (1.02), 3.508 (0.47), 4.039 (9.81), 4.253 (3.88), 4.268 (2.28), 4.948 (4.73), 4.972 (2.77), 5.225 (2.25), 5.243 (2.22), 5.754 (7.04), 6.782 (4.76), 6.803 (5.23), 6.888 (2.10), 6.907 (4.29), 6.925 (2.45), 7.149 (2.36), 7.167 (3.91), 7.184 (1.96), 7.305 (3.50), 7.325 (3.18), 7.454 (2.39), 7.477 (2.69), 7.483 (2.60), 7.652 (2.51), 7.670 (4.47), 7.681 (4.44), 7.721 (5.26), 7.737 (2.92), 7.910 (8.35), 7.916 (8.23), 8.163 (2.04), 8.338 (4.35), 8.341 (4.50), 8.359 (4.20), 8.362 (3.94), 8.642 (16.00), 8.717 (5.69), 9.213 (2.63), 9.233 (2.51).
569	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.78 min; MS (ESIpos): m/z = 549 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.40), 0.008 (2.06), 2.061 (1.27), 2.185 (1.12), 2.327 (0.94), 2.669 (0.87), 4.025 (5.86), 4.065 (0.57), 4.238 (1.84), 4.258 (2.64), 4.266 (2.99), 4.913 (1.72), 4.926 (3.39), 4.946 (3.52), 4.959 (1.75), 5.246 (1.74), 5.266 (1.56), 6.792 (3.51), 6.813 (3.85), 6.904 (1.66), 6.922 (3.36), 6.939 (2.06), 7.158 (1.80), 7.175 (2.74), 7.197 (1.28), 7.321 (2.74), 7.338 (2.56), 7.392 (1.86), 7.411 (2.11), 7.578 (2.92), 7.588 (4.18), 7.597 (5.85), 7.616 (4.05), 7.627 (5.32), 7.647 (1.93), 7.652 (2.84), 7.670 (3.21), 7.681 (2.98), 7.814 (3.61), 7.817 (3.83), 7.832 (3.05), 8.291 (3.30), 8.310 (3.02), 8.706 (16.00), 9.217 (2.96), 9.237 (2.95).
570	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.27 min; MS (ESIpos): m/z = 493 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (0.87), 0.008 (0.82), 1.308 (6.89), 1.327 (16.00), 1.345 (7.07), 2.024 (0.53), 2.039 (1.21), 2.049 (1.28), 2.058 (1.29), 2.066 (1.35), 2.075 (1.94), 2.083 (1.61), 2.090 (1.19), 2.099 (0.77), 2.180 (0.74), 2.190 (1.30), 2.203 (1.54), 2.213 (1.54), 2.225 (1.35), 2.243 (0.95), 2.256 (0.53), 3.233 (1.89), 3.252 (5.94), 3.271 (5.86), 3.289 (1.97), 4.220 (0.46), 4.229 (0.69), 4.249 (2.90), 4.258 (4.37), 4.268 (5.05), 4.275 (4.55), 4.284 (2.85), 4.302 (0.68), 5.294 (1.14), 5.309 (2.53), 5.329 (2.56), 5.344 (1.15), 6.785 (4.65), 6.805 (5.16), 6.910 (2.22), 6.913 (2.38), 6.931 (4.95), 6.948 (2.88), 6.950 (2.91), 7.148 (2.35), 7.152 (2.57), 7.169 (4.01), 7.187 (1.89), 7.190 (1.93), 7.348 (4.27), 7.366 (3.97), 7.402 (2.57), 7.421 (3.07), 7.587 (3.08), 7.606 (10.61), 7.626 (5.62), 7.639 (4.50), 7.639 (7.18), 7.658 (2.73), 7.756 (2.88), 7.774 (4.86), 7.795 (4.63), 7.845 (5.60), 7.847 (6.27), 7.862 (3.86), 7.865 (3.83), 8.305 (4.57), 8.324 (4.08), 8.326 (4.06), 8.800 (15.69), 9.096 (4.36), 9.117 (4.28).
571	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.21 min; MS (ESIpos): m/z = 479 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.051 (0.52), 2.060 (0.52), 2.087 (0.83), 2.095 (0.71), 2.206 (0.69), 2.217 (0.69), 2.227 (0.59), 2.793 (16.00), 4.247 (1.21), 4.266 (1.74), 4.272 (1.87), 4.287 (1.09), 5.288 (0.50), 5.303 (1.10), 5.323 (1.10), 5.338 (0.49), 6.788 (2.15), 6.808 (2.34), 6.911 (1.04), 6.927 (2.14), 6.946 (1.29), 7.154 (1.12), 7.171 (1.74), 7.189 (0.83), 7.350 (1.84), 7.369 (1.70), 7.405 (1.21), 7.425 (1.42), 7.591 (1.39), 7.610 (5.39), 7.629 (2.38), 7.646 (3.07), 7.665 (1.25), 7.758 (1.35), 7.776 (2.19), 7.797 (2.04), 7.857 (2.46), 7.860 (2.60), 7.875 (1.77), 7.878 (1.68), 8.268 (2.07), 8.271 (2.11), 8.289 (1.94), 8.292 (1.85), 8.810 (6.83), 9.075 (1.81), 9.095 (1.79).

[1955]

572	LC-MS (方法 L1): RI = 1.26 min; MS (ESIpos): m/z = 497 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.032 (0.65), 2.041 (0.71), 2.050 (0.76), 2.058 (0.79), 2.067 (1.04), 2.075 (0.91), 2.172 (0.41), 2.181 (0.73), 2.193 (0.92), 2.204 (0.91), 2.215 (0.83), 2.787 (16.00), 4.216 (0.41), 4.236 (1.41), 4.254 (2.29), 4.261 (2.58), 4.276 (1.47), 4.294 (0.44), 5.271 (0.58), 5.286 (1.35), 5.304 (1.38), 5.320 (0.61), 6.778 (2.39), 6.799 (2.67), 6.897 (1.24), 6.915 (2.63), 6.934 (1.54), 7.145 (1.36), 7.163 (2.20), 7.184 (1.05), 7.337 (2.34), 7.355 (2.19), 7.495 (2.29), 7.502 (1.52), 7.657 (0.42), 7.771 (6.93), 7.779 (3.68), 7.787 (3.32), 7.805 (0.67), 7.922 (2.71), 7.928 (2.67), 8.315 (1.92), 8.324 (1.81), 8.332 (1.66), 8.340 (1.74), 8.751 (4.10), 9.078 (2.11), 9.099 (2.06).
573	LC-MS (方法 L1): RI = 1.32 min; MS (ESIpos): m/z = 511 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.08), 0.008 (1.69), 1.311 (7.04), 1.329 (16.00), 1.348 (7.23), 2.018 (1.23), 2.028 (1.39), 2.037 (1.33), 2.053 (2.00), 2.062 (1.64), 2.188 (1.63), 2.198 (1.61), 2.210 (1.49), 2.229 (1.04), 2.241 (0.61), 2.327 (0.71), 2.670 (0.76), 3.241 (3.86), 3.260 (3.83), 4.217 (0.70), 4.236 (2.98), 4.246 (4.20), 4.256 (5.08), 4.263 (4.65), 4.272 (2.85), 4.290 (0.68), 5.274 (1.17), 5.289 (2.57), 5.308 (2.57), 5.323 (1.14), 6.776 (5.42), 6.796 (5.89), 6.887 (2.61), 6.899 (2.58), 6.915 (5.46), 6.934 (3.26), 7.140 (2.67), 7.144 (2.76), 7.161 (4.38), 7.179 (2.11), 7.332 (4.46), 7.351 (4.10), 7.492 (4.02), 7.498 (7.24), 7.504 (4.01), 7.755 (2.30), 7.767 (14.83), 7.772 (8.12), 7.785 (6.89), 7.803 (1.92), 7.919 (10.30), 7.925 (9.81), 8.348 (4.00), 8.355 (3.95), 8.367 (3.57), 8.373 (3.60), 8.742 (7.68), 8.747 (7.69), 9.108 (3.20), 9.127 (3.19).
574	LC-MS (方法 L1): RI = 0.91 min; MS (ESIpos): m/z = 480 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.196 (5.36), 1.216 (11.90), 1.234 (5.37), 2.071 (0.42), 2.613 (1.31), 2.632 (3.68), 2.651 (3.53), 2.669 (1.23), 3.055 (16.00), 4.243 (0.61), 4.251 (0.57), 4.262 (0.88), 4.270 (0.97), 4.284 (0.51), 5.245 (0.56), 5.264 (0.54), 6.788 (1.10), 6.806 (1.17), 6.902 (0.54), 6.905 (0.53), 6.921 (1.09), 6.939 (0.67), 6.942 (0.61), 7.064 (1.62), 7.148 (0.57), 7.152 (0.61), 7.169 (0.97), 7.191 (3.92), 7.351 (0.92), 7.368 (0.83), 7.598 (0.68), 7.606 (1.18), 7.626 (1.17), 7.657 (1.35), 7.661 (1.40), 7.675 (0.81), 7.679 (0.68), 8.153 (1.09), 8.156 (1.06), 8.173 (0.99), 8.177 (0.92), 8.573 (4.21), 9.076 (0.96), 9.096 (0.92).
575	LC-MS (方法 L1): RI = 1.22 min; MS (ESIpos): m/z = 477 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.315 (7.37), 1.334 (16.00), 1.352 (7.13), 2.016 (1.34), 2.026 (1.38), 2.034 (1.42), 2.051 (2.04), 2.060 (1.67), 2.188 (1.64), 2.210 (1.45), 2.224 (1.01), 2.327 (0.50), 2.669 (0.61), 3.238 (3.99), 3.245 (4.06), 3.257 (4.33), 4.256 (5.35), 4.271 (2.97), 5.276 (1.22), 5.290 (2.56), 5.309 (2.47), 5.324 (1.11), 6.773 (5.14), 6.792 (5.32), 6.895 (2.45), 6.913 (5.11), 6.932 (2.89), 7.141 (2.70), 7.159 (4.13), 7.176 (1.99), 7.330 (4.58), 7.349 (6.16), 7.359 (3.61), 7.363 (4.57), 7.425 (2.86), 7.431 (3.07), 7.444 (4.36), 7.451 (4.11), 7.464 (2.31), 7.470 (2.10), 7.693 (6.38), 7.697 (6.72), 7.702 (4.33), 7.705 (4.53), 7.713 (6.16), 7.717 (7.18), 7.719 (7.98), 7.723 (6.68), 7.752 (5.37), 7.772 (5.59), 7.790 (3.08), 8.326 (4.48), 8.329 (4.58), 8.347 (4.17), 8.718 (7.77), 8.724 (7.76), 9.099 (4.38), 9.120 (4.17).
582	LC-MS (方法 L1): RI = 0.99 min; MS (ESIpos): m/z = 514 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.161 (1.21), 1.180 (2.69), 1.196 (3.31), 1.216 (3.24), 1.230 (2.47), 1.235 (1.47), 1.249 (1.09), 1.356 (0.40), 2.044 (0.41), 2.184 (0.41), 2.595 (0.99), 2.609 (1.17), 2.628 (1.01), 2.728 (0.96), 2.745 (1.23), 2.763 (0.79), 3.065 (16.00), 4.229 (0.62), 4.237 (0.58), 4.248 (0.91), 4.256 (1.04), 4.270 (0.58), 5.227 (0.48), 5.241 (0.48), 6.774 (1.04), 6.794 (1.15), 6.883 (0.48), 6.902 (1.01), 6.920 (0.59), 6.967 (0.72), 6.972 (0.72), 6.996 (0.74), 7.001 (0.75), 7.138 (0.56), 7.156 (0.90), 7.174 (0.45), 7.218 (1.64), 7.223 (1.57), 7.331 (0.76), 7.350 (0.71), 7.560 (0.70), 7.567 (1.32), 7.595 (1.22), 7.616 (1.30), 7.633 (0.71), 8.199 (1.07), 8.203 (1.13), 8.220 (1.01), 8.224 (1.00), 8.506 (2.86), 9.055 (0.47), 9.073 (0.74), 9.092 (0.49).
583	LC-MS (方法 L1): RI = 1.20 min; MS (ESIpos): m/z = 556 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.008 (1.62), 1.142 (0.89), 1.161 (6.60), 1.180 (13.02), 1.195 (16.00), 1.216 (15.26), 1.229 (11.19), 1.234 (6.42), 1.248 (5.03), 1.356 (2.57), 2.034 (1.17), 2.061 (1.72), 2.182 (1.53), 2.194 (1.58), 2.207 (1.56), 2.217 (1.57), 2.327 (0.56), 2.366 (0.40), 2.578 (1.59), 2.596 (4.14), 2.610 (4.95), 2.629 (4.33), 2.648 (1.32), 2.709 (1.71), 2.728 (3.88), 2.745 (4.90), 2.763 (3.19), 3.875 (11.89), 4.211 (0.84), 4.232 (2.57), 4.252 (3.80), 4.262 (3.67), 4.279 (2.36), 5.242 (2.14), 5.256 (2.13), 6.776 (4.90), 6.796 (5.51), 6.892 (1.72), 6.910 (3.66), 6.929 (2.06), 6.969 (3.24), 6.974 (3.27), 7.000 (3.63), 7.005 (3.58), 7.141 (2.39), 7.161 (3.89), 7.180 (2.02), 7.225 (7.39), 7.230 (6.95), 7.352 (4.16), 7.370 (3.84), 7.591 (3.42), 7.607 (5.69), 7.646 (5.21), 7.667 (5.45), 7.685 (3.27), 8.243 (4.62), 8.246 (4.72), 8.263 (4.30), 8.267 (4.07), 8.566 (8.87), 8.571 (9.34), 9.136 (2.13), 9.154 (3.49), 9.173 (2.18).

[1956]

585	LC-MS (方法 L4): Rt = 3.93 min; MS (ESipos): m/z = 520 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (0.77), 0.008 (0.70), 2.009 (0.45), 2.124 (0.42), 2.137 (0.56), 2.159 (0.67), 2.173 (0.54), 2.729 (16.00), 3.132 (8.33), 3.140 (9.59), 4.242 (1.09), 4.256 (1.79), 4.268 (1.30), 4.285 (0.74), 4.304 (0.47), 4.313 (0.51), 5.228 (0.59), 5.244 (0.74), 5.261 (0.70), 5.277 (0.49), 5.754 (5.28), 6.788 (0.97), 6.800 (1.15), 6.807 (1.12), 6.818 (1.26), 6.861 (0.47), 6.879 (1.00), 6.898 (0.64), 6.905 (0.63), 6.923 (1.16), 6.942 (0.70), 7.145 (0.53), 7.163 (1.32), 7.184 (1.31), 7.201 (1.14), 7.217 (0.79), 7.322 (0.99), 7.341 (0.88), 7.673 (1.37), 7.677 (3.00), 7.682 (2.18), 7.707 (7.29), 7.712 (5.77), 7.789 (0.70), 7.809 (2.12), 7.827 (3.94), 7.832 (2.99), 7.849 (0.62), 7.852 (0.68), 7.975 (1.92), 7.980 (1.72), 7.991 (1.71), 7.996 (1.45), 9.158 (4.20), 9.183 (4.34), 9.199 (1.01).
586	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.98 min; MS (ESipos): m/z = 494 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.313 (16.00), 2.359 (3.34), 3.056 (5.98), 4.262 (0.45), 4.271 (0.52), 6.788 (0.52), 6.809 (0.57), 6.924 (0.54), 7.173 (1.16), 7.218 (0.69), 7.346 (0.96), 7.367 (0.45), 7.611 (0.52), 7.631 (0.52), 7.659 (0.59), 8.157 (0.42), 8.564 (1.24), 9.083 (0.42), 9.103 (0.42).
587	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.18 min; MS (ESipos): m/z = 536 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.295 (2.20), 1.313 (16.00), 2.360 (4.01), 3.276 (1.42), 3.287 (1.54), 3.875 (2.03), 4.268 (0.54), 6.789 (0.67), 6.810 (0.75), 6.932 (0.71), 6.950 (0.41), 7.156 (0.40), 7.175 (1.57), 7.225 (0.98), 7.349 (1.06), 7.373 (0.71), 7.392 (0.56), 7.659 (0.78), 7.679 (0.75), 7.698 (0.86), 7.712 (0.44), 8.213 (0.58), 8.230 (0.53), 8.623 (1.85), 9.157 (0.60), 9.178 (0.59).
588	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.14 min; MS (ESipos): m/z = 522 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.01), 0.008 (0.99), 1.197 (7.08), 1.216 (16.00), 1.234 (7.43), 2.069 (0.55), 2.096 (0.46), 2.208 (0.52), 2.220 (0.48), 2.230 (0.47), 2.327 (0.44), 2.522 (1.17), 2.615 (1.76), 2.634 (5.17), 2.653 (5.02), 2.671 (1.92), 3.243 (0.45), 3.262 (1.26), 3.275 (2.62), 3.287 (2.82), 3.874 (4.06), 4.245 (0.80), 4.253 (0.63), 4.267 (1.07), 4.277 (1.01), 4.293 (0.68), 5.259 (0.75), 5.278 (0.75), 5.754 (1.39), 6.789 (1.42), 6.810 (1.58), 6.913 (0.73), 6.932 (1.50), 6.948 (0.89), 6.951 (0.88), 7.073 (2.20), 7.152 (0.74), 7.156 (0.80), 7.173 (1.25), 7.194 (5.31), 7.373 (1.25), 7.391 (1.18), 7.638 (0.84), 7.656 (1.64), 7.676 (1.69), 7.695 (1.79), 7.699 (2.07), 7.713 (0.99), 7.717 (0.85), 8.208 (1.34), 8.212 (1.38), 8.229 (1.26), 8.233 (1.22), 8.629 (5.50), 9.153 (1.39), 9.173 (1.34).
592	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.14 min; MS (ESipos): m/z = 479 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.234 (0.47), 2.106 (0.61), 2.117 (0.70), 2.129 (0.79), 2.134 (0.71), 2.262 (0.49), 2.273 (0.68), 2.283 (0.72), 2.290 (0.70), 2.301 (0.52), 4.035 (0.41), 4.195 (0.49), 4.200 (0.56), 4.218 (1.25), 4.235 (0.87), 4.240 (0.70), 4.289 (0.70), 4.295 (0.92), 4.301 (0.85), 4.308 (0.93), 4.318 (0.57), 4.323 (0.56), 4.330 (0.43), 4.742 (1.91), 5.390 (0.52), 5.400 (1.12), 5.416 (1.11), 5.427 (0.51), 5.554 (0.98), 6.793 (2.09), 6.808 (2.27), 6.937 (1.02), 6.952 (2.13), 6.966 (1.23), 7.163 (1.03), 7.166 (1.07), 7.180 (1.76), 7.194 (0.87), 7.197 (0.82), 7.410 (1.80), 7.424 (1.69), 7.665 (16.00), 7.737 (1.30), 7.752 (2.11), 7.768 (1.83), 7.845 (2.28), 7.848 (2.39), 7.860 (1.82), 7.862 (1.73), 7.967 (1.51), 7.984 (1.29), 8.488 (0.66), 9.045 (5.88), 9.260 (1.85), 9.277 (1.82).
593	1.18 min; MS (ESipos): m/z = 493 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.190 (0.46), 2.062 (0.53), 2.068 (0.53), 2.076 (0.53), 2.090 (0.66), 2.096 (0.59), 2.213 (0.59), 2.223 (0.59), 2.230 (0.53), 2.362 (0.53), 2.519 (0.72), 2.522 (0.53), 2.636 (0.53), 3.460 (0.99), 3.473 (2.24), 3.487 (1.32), 3.780 (1.05), 3.790 (1.51), 3.799 (0.99), 4.230 (0.46), 4.246 (1.12), 4.253 (0.79), 4.263 (1.05), 4.268 (1.32), 4.275 (0.99), 4.281 (0.79), 4.288 (0.86), 5.091 (0.86), 5.101 (1.78), 5.111 (0.79), 5.286 (0.40), 5.297 (0.86), 5.314 (0.86), 6.786 (1.91), 6.789 (1.91), 6.803 (2.17), 6.805 (2.11), 6.906 (1.05), 6.908 (1.12), 6.921 (1.91), 6.923 (1.84), 6.935 (1.19), 6.938 (1.12), 7.153 (0.99), 7.156 (0.99), 7.170 (1.51), 7.184 (0.79), 7.352 (1.12), 7.359 (1.58), 7.374 (1.38), 7.537 (0.40), 7.648 (4.54), 7.651 (16.00), 7.654 (3.23), 7.659 (0.72), 7.693 (0.66), 7.754 (1.45), 7.769 (1.91), 7.771 (1.65), 7.786 (1.78), 7.877 (2.17), 7.880 (2.24), 7.891 (1.78), 7.894 (1.65), 8.359 (1.58), 8.362 (1.65), 8.377 (1.58), 8.869 (7.57), 9.225 (1.65), 9.242 (1.58).

[1957]

594	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.04 min; MS (ESIpos): m/z = 505 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.050 (0.60), 2.058 (0.65), 2.069 (0.70), 2.085 (0.97), 2.092 (0.83), 2.100 (0.60), 2.197 (0.65), 2.209 (0.88), 2.221 (0.86), 2.230 (0.81), 2.243 (0.56), 2.252 (0.44), 2.327 (0.42), 2.429 (16.00), 2.670 (0.44), 3.252 (0.90), 3.272 (2.69), 3.283 (5.98), 3.295 (7.10), 3.867 (4.41), 3.878 (7.26), 3.889 (4.17), 4.224 (0.46), 4.245 (1.41), 4.252 (1.14), 4.266 (1.97), 4.275 (1.86), 4.292 (1.23), 4.311 (0.44), 5.243 (0.60), 5.257 (1.32), 5.276 (1.32), 5.290 (0.58), 6.788 (2.37), 6.809 (2.62), 6.914 (1.18), 6.916 (1.21), 6.933 (2.50), 6.951 (1.48), 7.153 (1.23), 7.156 (1.30), 7.174 (2.09), 7.192 (1.02), 7.195 (1.00), 7.376 (2.23), 7.394 (2.09), 7.685 (3.87), 7.702 (2.60), 7.723 (2.30), 7.741 (3.73), 7.802 (2.78), 7.805 (2.92), 7.820 (2.32), 7.823 (2.62), 7.831 (3.66), 8.267 (2.32), 8.270 (2.39), 8.288 (2.20), 8.291 (2.13), 8.679 (8.26), 9.161 (2.34), 9.182 (2.30).
598	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.84 min; MS (ESIpos): m/z = 463 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (0.75), 0.008 (0.48), 2.068 (0.58), 2.076 (0.47), 2.175 (0.42), 2.188 (0.51), 2.199 (0.49), 2.209 (0.45), 2.427 (9.40), 2.523 (1.01), 3.070 (16.00), 4.242 (0.87), 4.250 (0.80), 4.261 (1.24), 4.269 (1.37), 4.284 (0.72), 5.241 (0.79), 5.261 (0.75), 6.785 (1.39), 6.787 (1.45), 6.805 (1.56), 6.808 (1.54), 6.905 (0.76), 6.908 (0.76), 6.924 (1.51), 6.926 (1.43), 6.942 (0.91), 6.945 (0.84), 7.149 (0.77), 7.153 (0.79), 7.170 (1.19), 7.187 (0.59), 7.191 (0.55), 7.354 (1.25), 7.372 (1.15), 7.632 (1.11), 7.650 (1.59), 7.654 (1.36), 7.672 (1.79), 7.680 (1.98), 7.737 (2.19), 7.739 (2.19), 7.762 (1.69), 7.766 (1.74), 7.780 (1.33), 7.783 (1.21), 7.828 (2.17), 8.220 (1.41), 8.223 (1.38), 8.241 (1.29), 8.244 (1.19), 8.613 (3.96), 9.082 (1.26), 9.103 (1.19).
600	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.13 min; MS (ESIpos): m/z = 447 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.033 (0.49), 2.041 (0.52), 2.068 (0.76), 2.076 (0.68), 2.195 (0.64), 2.205 (0.65), 2.216 (0.57), 2.783 (16.00), 4.236 (1.14), 4.255 (1.65), 4.262 (1.79), 4.276 (1.08), 5.274 (0.47), 5.288 (1.06), 5.308 (1.05), 5.323 (0.49), 6.778 (2.06), 6.799 (2.26), 6.898 (1.00), 6.914 (2.08), 6.933 (1.25), 7.141 (1.01), 7.145 (1.08), 7.163 (1.66), 7.180 (0.81), 7.266 (1.14), 7.274 (1.67), 7.289 (1.20), 7.296 (1.69), 7.303 (1.14), 7.311 (0.77), 7.324 (1.88), 7.333 (2.15), 7.345 (1.33), 7.354 (2.23), 7.584 (1.59), 7.597 (1.64), 7.606 (1.48), 7.619 (1.41), 7.717 (1.13), 7.720 (1.36), 7.734 (2.93), 7.738 (2.68), 7.753 (2.46), 7.773 (2.49), 7.791 (1.20), 8.293 (1.91), 8.297 (2.02), 8.314 (1.85), 8.318 (1.75), 8.738 (6.49), 9.072 (1.70), 9.093 (1.64).
601	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.01 min; MS (ESIpos): m/z = 528 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (0.79), 0.008 (0.75), 1.270 (12.17), 1.284 (12.89), 2.388 (3.41), 2.401 (3.26), 2.523 (0.94), 3.065 (16.00), 4.232 (0.55), 4.245 (0.88), 4.255 (1.03), 4.270 (0.61), 5.224 (0.60), 5.243 (0.60), 5.754 (1.14), 6.774 (1.15), 6.795 (1.28), 6.885 (0.58), 6.903 (1.22), 6.922 (0.69), 7.096 (0.63), 7.102 (0.70), 7.123 (0.72), 7.128 (0.75), 7.135 (0.65), 7.139 (0.65), 7.156 (0.97), 7.178 (0.46), 7.331 (0.94), 7.350 (0.87), 7.411 (1.63), 7.416 (1.58), 7.550 (0.92), 7.565 (1.38), 7.601 (1.33), 7.621 (1.46), 7.639 (0.85), 8.203 (1.13), 8.206 (1.22), 8.224 (1.07), 8.228 (1.06), 8.503 (1.65), 8.508 (1.79), 9.069 (1.03), 9.089 (1.02).
602	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.72 min; MS (ESIpos): m/z = 517 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (2.43), 0.008 (2.43), 2.005 (1.56), 2.014 (1.65), 2.040 (2.57), 2.048 (2.04), 2.174 (2.09), 2.186 (2.16), 2.196 (2.02), 2.327 (0.80), 2.366 (0.85), 2.669 (0.73), 2.710 (0.83), 4.032 (11.82), 4.207 (1.19), 4.227 (3.60), 4.235 (3.19), 4.246 (5.44), 4.254 (6.06), 4.270 (3.19), 4.287 (1.12), 4.938 (5.67), 4.956 (5.44), 5.217 (1.58), 5.231 (3.35), 5.251 (3.28), 5.265 (1.40), 6.782 (6.82), 6.803 (7.51), 6.889 (3.33), 6.907 (6.61), 6.924 (4.02), 7.145 (3.35), 7.149 (3.63), 7.166 (5.42), 7.187 (2.64), 7.252 (2.89), 7.274 (2.87), 7.293 (2.71), 7.307 (6.36), 7.314 (5.28), 7.323 (7.92), 7.335 (2.94), 7.343 (3.32), 7.576 (3.70), 7.589 (4.11), 7.598 (3.56), 7.611 (3.28), 7.650 (2.62), 7.667 (7.67), 7.686 (13.61), 7.701 (2.46), 8.132 (3.35), 8.319 (5.26), 8.325 (4.96), 8.338 (4.77), 8.344 (4.55), 8.642 (16.00), 8.708 (6.38), 9.213 (4.73), 9.234 (4.61).

[1958]

603	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 1.20 min; MS (ESIpos): m/z = 461 [M+H]⁺</p>	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 1.312 (7.07), 1.330 (16.00), 1.349 (7.30), 2.004 (0.55), 2.019 (1.26), 2.030 (1.33), 2.038 (1.35), 2.047 (1.47), 2.055 (2.00), 2.063 (2.07), 2.071 (1.26), 2.079 (0.81), 2.167 (0.77), 2.178 (1.39), 2.190 (1.60), 2.200 (1.63), 2.212 (1.45), 2.226 (1.03), 2.243 (0.57), 3.220 (1.71), 3.238 (4.68), 3.256 (4.64), 3.274 (1.72), 4.218 (0.71), 4.237 (3.03), 4.246 (4.63), 4.256 (5.41), 4.263 (4.80), 4.272 (3.05), 4.291 (0.73), 5.278 (1.19), 5.293 (2.62), 5.312 (2.65), 5.328 (1.20), 6.775 (4.64), 6.795 (5.15), 6.897 (2.35), 6.900 (2.37), 6.916 (5.03), 6.934 (3.02), 7.139 (2.49), 7.143 (2.59), 7.160 (4.16), 7.178 (2.02), 7.181 (1.96), 7.269 (2.88), 7.276 (4.09), 7.292 (3.57), 7.299 (6.76), 7.307 (2.30), 7.321 (4.84), 7.330 (5.77), 7.342 (3.34), 7.350 (5.55), 7.436 (0.55), 7.444 (0.73), 7.460 (2.03), 7.470 (1.50), 7.483 (0.63), 7.488 (0.63), 7.582 (3.46), 7.595 (3.67), 7.604 (3.36), 7.617 (3.13), 7.635 (0.42), 7.708 (2.96), 7.712 (3.38), 7.726 (6.55), 7.729 (6.17), 7.751 (5.10), 7.772 (5.47), 7.790 (2.85), 8.326 (4.37), 8.329 (4.51), 8.347 (4.16), 8.350 (4.04), 8.731 (14.58), 9.104 (4.09), 9.124 (3.99).</p>
604	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 0.76 min; MS (ESIpos): m/z = 517 [M+H]⁺</p>	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.008 (3.57), 0.008 (3.20), 2.011 (1.02), 2.020 (1.09), 2.046 (1.71), 2.054 (1.42), 2.167 (1.15), 2.178 (1.46), 2.189 (1.42), 2.200 (1.38), 2.327 (1.33), 2.366 (0.84), 2.523 (2.88), 2.669 (1.31), 2.710 (0.80), 3.998 (0.69), 4.038 (7.81), 4.078 (0.67), 4.210 (0.82), 4.230 (2.51), 4.238 (2.22), 4.249 (3.71), 4.258 (4.19), 4.272 (2.17), 4.927 (2.42), 4.940 (4.59), 4.963 (4.55), 4.975 (2.31), 5.221 (1.04), 5.234 (2.24), 5.255 (2.20), 5.268 (0.95), 6.785 (4.62), 6.806 (4.88), 6.892 (2.31), 6.911 (4.53), 6.929 (2.71), 6.954 (0.51), 6.961 (0.47), 6.974 (0.51), 6.990 (0.47), 7.149 (2.60), 7.170 (3.77), 7.187 (1.84), 7.191 (1.80), 7.200 (0.51), 7.313 (4.11), 7.320 (3.57), 7.330 (3.82), 7.342 (6.10), 7.365 (3.68), 7.486 (3.11), 7.493 (4.44), 7.502 (3.13), 7.508 (4.84), 7.522 (3.02), 7.529 (1.75), 7.533 (2.37), 7.540 (1.93), 7.544 (2.24), 7.551 (1.58), 7.650 (3.11), 7.667 (4.50), 7.671 (3.77), 7.688 (4.24), 7.776 (4.79), 7.791 (3.62), 8.133 (0.44), 8.323 (4.42), 8.326 (4.28), 8.344 (4.04), 8.347 (3.75), 8.661 (16.00), 8.710 (5.68), 9.208 (3.97), 9.228 (3.79), 10.355 (1.09).</p>
605	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 1.16 min; MS (ESIpos): m/z = 447 [M+H]⁺</p>	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: 0.038 (0.55), 2.048 (0.59), 2.057 (0.62), 2.064 (0.65), 2.074 (0.89), 2.082 (0.75), 2.089 (0.55), 2.185 (0.61), 2.197 (0.74), 2.209 (0.73), 2.219 (0.68), 2.787 (16.00), 4.239 (1.30), 4.248 (1.30), 4.258 (1.93), 4.265 (2.14), 4.279 (1.20), 5.277 (0.53), 5.292 (1.20), 5.311 (1.21), 5.326 (0.54), 6.780 (2.05), 6.800 (2.32), 6.901 (1.05), 6.920 (2.28), 6.938 (1.33), 7.148 (1.14), 7.166 (1.88), 7.183 (0.88), 7.333 (1.49), 7.343 (2.14), 7.356 (3.17), 7.378 (1.66), 7.505 (1.11), 7.511 (1.81), 7.526 (2.33), 7.534 (1.46), 7.545 (1.03), 7.556 (1.03), 7.562 (0.70), 7.757 (1.11), 7.776 (2.36), 7.796 (2.24), 7.821 (2.68), 7.836 (1.38), 8.304 (2.03), 8.325 (1.92), 8.769 (6.05), 9.077 (1.92), 9.097 (1.89).</p>
607	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 1.26 min; MS (ESIpos): m/z = 570 [M+H]⁺</p>	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.149 (0.48), -0.008 (3.63), 0.008 (3.53), 0.146 (0.46), 1.175 (0.42), 1.269 (14.91), 1.283 (16.00), 1.398 (0.57), 1.988 (0.79), 2.065 (0.44), 2.195 (0.48), 2.327 (0.69), 2.366 (0.79), 2.388 (4.14), 2.401 (3.93), 2.669 (0.75), 2.709 (0.77), 3.283 (1.88), 3.876 (3.43), 4.231 (0.63), 4.252 (1.03), 4.279 (0.69), 5.238 (0.73), 5.258 (0.77), 5.754 (0.79), 6.776 (1.43), 6.797 (1.53), 6.891 (0.65), 6.910 (1.35), 6.928 (0.81), 7.102 (0.85), 7.131 (0.91), 7.143 (0.77), 7.161 (1.15), 7.180 (0.54), 7.353 (1.27), 7.370 (1.19), 7.418 (2.00), 7.424 (1.98), 7.590 (1.03), 7.607 (1.61), 7.652 (1.47), 7.673 (1.61), 7.690 (1.01), 8.250 (1.37), 8.267 (1.23), 8.564 (1.86), 8.572 (2.04), 9.148 (1.21), 9.168 (1.17).</p>
608	<p>LC-MS (方法 L1): Rt = 1.12 min; MS (ESIpos): m/z = 559 [M+H]⁺</p>	<p>¹H-NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ [ppm]: -0.008 (2.94), 0.008 (2.84), 2.026 (1.36), 2.034 (1.46), 2.045 (1.57), 2.061 (2.14), 2.068 (1.86), 2.076 (1.39), 2.183 (1.38), 2.196 (1.99), 2.207 (1.94), 2.217 (1.90), 2.230 (1.30), 2.252 (0.65), 2.327 (0.62), 2.366 (0.58), 2.669 (0.72), 2.710 (0.61), 3.254 (1.39), 3.294 (9.84), 3.879 (15.30), 4.202 (0.81), 4.209 (1.06), 4.230 (3.23), 4.238 (2.57), 4.251 (4.00), 4.263 (3.86), 4.279 (2.90), 4.298 (1.09), 4.306 (0.75), 5.239 (2.49), 5.253 (2.51), 5.754 (2.12), 6.778 (5.59), 6.798 (6.16), 6.895 (2.42), 6.913 (5.26), 6.932 (3.13), 7.142 (2.78), 7.146 (3.03), 7.164 (4.72), 7.181 (2.33), 7.185 (2.30), 7.354 (5.00), 7.372 (4.65), 7.706 (2.07), 7.724 (7.43), 7.737 (7.97), 7.742 (16.00), 7.754 (2.22), 7.868 (2.90), 7.892 (3.07), 7.917 (3.30), 7.921 (3.26), 8.052 (0.43), 8.297 (0.70), 8.310 (4.84), 8.316 (4.51), 8.328 (4.39), 8.334 (4.48), 8.342 (7.65), 8.347 (7.65), 8.604 (10.28), 8.706 (0.70), 9.165 (3.36), 9.184 (3.22).</p>

[1959]

624	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.97 min; MS (ESIpos): m/z = 517 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: -0.008 (1.20), 0.008 (1.22), 2.044 (0.43), 2.185 (0.41), 2.195 (0.40), 3.080 (16.00), 4.227 (0.67), 4.246 (1.04), 4.254 (1.15), 4.269 (0.62), 5.235 (0.51), 5.754 (3.68), 6.776 (1.33), 6.796 (1.47), 6.887 (0.57), 6.905 (1.24), 6.924 (0.75), 7.142 (0.65), 7.159 (1.03), 7.180 (0.52), 7.331 (0.80), 7.350 (0.73), 7.652 (0.64), 7.670 (1.58), 7.690 (2.46), 7.697 (1.81), 7.710 (0.61), 7.882 (0.81), 7.908 (0.84), 8.278 (1.17), 8.283 (1.16), 8.298 (1.11), 8.303 (1.04), 8.333 (2.42), 8.337 (2.34), 8.531 (4.40), 9.078 (0.75), 9.098 (0.70).
628	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.22 min; MS (ESIpos): m/z = 461 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.308 (7.60), 1.326 (16.00), 1.345 (7.79), 2.061 (2.32), 2.203 (2.13), 2.327 (0.52), 2.670 (0.63), 3.243 (6.84), 3.262 (6.74), 3.280 (2.77), 4.260 (6.66), 5.298 (3.26), 5.314 (3.18), 6.777 (5.35), 6.797 (5.91), 6.903 (2.66), 6.921 (5.56), 6.940 (3.25), 7.145 (3.07), 7.163 (4.94), 7.182 (2.42), 7.339 (6.05), 7.354 (9.10), 7.375 (3.63), 7.511 (5.22), 7.526 (7.31), 7.550 (2.82), 7.756 (2.29), 7.774 (5.35), 7.794 (5.18), 7.810 (7.32), 7.827 (3.38), 8.338 (4.91), 8.358 (4.55), 8.763 (13.33), 9.106 (4.65), 9.126 (4.63).
631	LC-MS (方法 L4): Rt = 3.90 min; MS (ESIpos): m/z = 534 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.091 (0.41), 1.235 (1.08), 1.259 (0.68), 1.299 (0.43), 2.066 (16.00), 2.100 (0.88), 2.214 (0.78), 2.226 (0.77), 2.235 (0.72), 2.268 (1.76), 2.328 (0.58), 2.669 (0.60), 2.750 (15.89), 4.208 (0.55), 4.228 (1.45), 4.249 (1.16), 4.258 (1.27), 4.269 (1.15), 4.286 (1.02), 5.143 (5.73), 5.250 (0.77), 5.282 (1.13), 5.301 (1.12), 6.790 (2.18), 6.810 (2.37), 6.917 (1.17), 6.935 (2.21), 6.953 (1.25), 7.157 (1.18), 7.177 (1.96), 7.195 (0.95), 7.381 (1.90), 7.400 (1.94), 7.654 (11.00), 7.658 (5.85), 7.723 (1.28), 7.741 (1.94), 7.762 (1.68), 7.882 (2.40), 7.898 (1.87), 8.251 (2.03), 8.270 (1.81), 8.917 (0.60), 8.948 (6.71), 9.278 (1.90), 9.298 (1.82).
643	LC-MS (方法 L1): Rt = 0.91 min; MS (ESIpos): m/z = 520 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 0.008 (0.88), 2.069 (0.52), 2.238 (16.00), 2.669 (1.25), 3.317 (2.60), 3.422 (1.31), 3.438 (1.42), 3.460 (1.08), 4.250 (0.72), 4.269 (1.14), 4.278 (1.25), 4.293 (0.65), 5.290 (0.69), 5.310 (0.69), 5.754 (0.94), 6.792 (1.36), 6.812 (1.48), 6.900 (0.70), 6.919 (1.32), 6.937 (0.81), 7.158 (0.66), 7.175 (1.10), 7.193 (0.52), 7.366 (1.17), 7.383 (1.06), 7.654 (11.60), 7.771 (0.81), 7.789 (1.28), 7.810 (1.17), 7.865 (1.61), 7.900 (1.17), 8.145 (3.08), 8.283 (1.19), 8.302 (1.09), 8.671 (4.70), 9.325 (1.18), 9.345 (1.13).
645	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.18 min; MS (ESIpos): m/z = 443 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 2.039 (0.59), 2.046 (0.63), 2.054 (0.65), 2.059 (0.66), 2.067 (0.88), 2.072 (1.06), 2.080 (0.51), 2.186 (0.59), 2.196 (0.76), 2.205 (0.79), 2.212 (0.72), 2.224 (0.47), 2.229 (0.41), 2.335 (10.23), 2.779 (16.00), 4.223 (0.40), 4.239 (1.31), 4.246 (1.16), 4.254 (2.05), 4.261 (2.12), 4.274 (1.15), 5.280 (0.52), 5.292 (1.13), 5.307 (1.10), 5.319 (0.50), 6.780 (2.18), 6.795 (2.35), 6.900 (1.09), 6.901 (1.08), 6.915 (2.22), 6.929 (1.29), 6.931 (1.20), 7.145 (1.11), 7.147 (1.14), 7.161 (1.96), 7.176 (3.03), 7.178 (3.05), 7.239 (1.53), 7.242 (1.36), 7.255 (1.82), 7.258 (1.60), 7.338 (1.91), 7.353 (1.78), 7.411 (2.22), 7.427 (1.81), 7.663 (1.80), 7.666 (1.84), 7.677 (2.62), 7.680 (2.49), 7.731 (2.08), 7.746 (1.86), 7.748 (2.32), 7.762 (1.51), 8.280 (2.18), 8.282 (2.20), 8.277 (2.05), 8.279 (1.93), 8.716 (5.69), 9.065 (1.86), 9.082 (1.80).
646	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.24 min; MS (ESIpos): m/z = 457 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d6): δ [ppm] = 9.10 (br d, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.30 (d, 1H), 7.75 (t, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.25 (dd, 1H), 7.19-7.14 (m, 2H), 6.92 (t, 1H), 6.78 (d, 1H), 5.33-5.28 (m, 1H), 4.29-4.22 (m, 2H), 3.36 (br s, 1H), 3.28-3.20 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.27-2.16 (m, 1H), 2.05 (ddd, 1H), 1.33 (t, 3H).
653	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.20 min; MS (ESIpos): m/z = 531 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d6) δ [ppm]: 1.160 (0.41), 1.175 (1.01), 1.189 (0.61), 1.235 (0.61), 1.397 (2.84), 1.988 (3.65), 2.004 (2.63), 2.085 (7.09), 2.155 (2.63), 2.165 (2.62), 2.172 (2.43), 2.362 (1.01), 2.432 (3.04), 2.636 (0.61), 3.375 (0.61), 3.904 (2.23), 4.023 (0.61), 4.037 (0.61), 4.219 (4.46), 4.242 (6.08), 4.249 (6.08), 4.256 (5.47), 4.263 (5.87), 4.278 (3.24), 5.233 (3.44), 5.247 (3.44), 5.752 (2.23), 5.856 (5.06), 6.764 (9.32), 6.766 (9.72), 6.780 (10.33), 6.782 (10.33), 6.888 (2.84), 6.902 (5.87), 6.918 (3.24), 7.138 (4.25), 7.141 (4.46), 7.155 (7.29), 7.169 (3.65), 7.334 (6.08), 7.349 (6.48), 7.375 (4.46), 7.441 (3.85), 7.447 (4.46), 7.457 (6.48), 7.463 (6.89), 7.472 (3.24), 7.478 (3.44), 7.708 (11.75), 7.711 (11.75), 7.724 (15.39), 7.728 (16.00), 7.738 (14.38), 7.742 (12.95), 7.751 (12.76), 7.767 (12.35), 7.781 (5.67), 8.059 (9.11), 8.062 (9.11), 8.075 (7.90), 8.078 (7.49), 8.819 (13.57), 8.827 (13.57), 8.933 (5.27), 8.949 (4.25).

[1960]

654	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.17 min; MS (ES/pos): m/z = 587 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 氮仿 -d) δ [ppm]: 0.006 (1.86), 1.222 (0.43), 1.255 (1.78), 1.549 (4.29), 2.005 (0.63), 2.009 (0.62), 2.025 (0.45), 2.034 (0.78), 2.038 (0.71), 2.170 (2.80), 2.175 (0.46), 2.270 (0.45), 2.281 (0.47), 2.285 (0.45), 2.292 (0.67), 2.302 (0.60), 3.056 (15.99), 3.423 (4.44), 3.459 (16.00), 3.534 (4.30), 4.074 (0.85), 4.079 (0.78), 4.097 (1.34), 4.101 (1.18), 4.119 (0.75), 4.124 (0.61), 4.294 (0.63), 4.302 (1.10), 4.311 (0.65), 4.317 (0.54), 4.325 (0.84), 4.333 (0.42), 5.348 (0.49), 5.358 (0.84), 5.367 (0.90), 5.375 (0.81), 5.385 (0.43), 6.731 (0.89), 6.733 (0.88), 6.746 (1.75), 6.760 (1.01), 6.762 (0.97), 6.823 (2.09), 6.840 (2.28), 6.922 (0.50), 7.080 (1.31), 7.092 (1.92), 7.099 (1.43), 7.105 (1.69), 7.178 (1.13), 7.181 (0.97), 7.195 (1.67), 7.209 (1.14), 7.212 (1.11), 7.220 (5.56), 7.282 (0.46), 7.376 (1.54), 7.423 (2.79), 7.427 (3.79), 7.430 (1.97), 7.526 (2.61), 7.532 (7.59), 7.536 (6.59), 7.590 (1.03), 7.604 (1.42), 7.607 (1.87), 7.621 (2.19), 7.645 (2.30), 7.648 (2.42), 7.656 (0.71), 7.662 (1.26), 7.665 (1.03), 7.736 (2.01), 7.739 (1.84), 7.749 (2.20), 7.752 (1.94), 7.764 (0.48), 7.766 (0.43), 7.818 (0.54), 7.821 (0.50), 7.835 (0.46), 9.108 (1.57), 9.133 (5.65).
655	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.18 min; MS (ES/pos): m/z = 463 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.311 (7.80), 1.327 (16.00), 1.341 (7.58), 2.033 (1.52), 2.041 (1.61), 2.047 (1.74), 2.054 (1.78), 2.061 (2.13), 2.067 (1.87), 2.198 (1.93), 2.207 (1.91), 2.215 (1.83), 3.235 (2.53), 3.250 (6.81), 3.265 (6.83), 3.279 (3.01), 4.227 (1.01), 4.244 (3.29), 4.258 (5.03), 4.264 (5.39), 4.276 (3.07), 4.290 (0.97), 5.288 (1.40), 5.300 (2.99), 5.315 (2.94), 5.327 (1.35), 6.781 (5.15), 6.797 (5.61), 6.909 (2.60), 6.924 (5.33), 6.939 (3.03), 7.151 (2.73), 7.165 (4.53), 7.180 (2.23), 7.228 (2.53), 7.236 (2.62), 7.345 (4.77), 7.360 (4.45), 7.601 (2.02), 7.607 (2.10), 7.614 (2.02), 7.782 (2.66), 7.797 (5.11), 7.813 (4.47), 7.845 (6.38), 7.857 (3.89), 8.374 (4.77), 8.389 (4.49), 8.789 (13.74), 9.121 (4.49), 9.137 (4.40).
676	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.27 min; MS (ES/pos): m/z = 437 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.319 (6.59), 1.334 (14.59), 1.349 (6.59), 1.869 (13.65), 2.031 (1.41), 2.052 (1.88), 2.059 (1.41), 2.200 (1.41), 2.292 (16.00), 2.362 (1.41), 2.636 (1.88), 3.236 (3.29), 3.251 (3.76), 3.375 (0.94), 3.418 (0.94), 4.238 (2.35), 4.253 (3.29), 4.259 (3.76), 4.271 (2.35), 5.282 (0.94), 5.295 (1.88), 5.310 (1.88), 6.778 (4.24), 6.793 (4.71), 6.901 (1.88), 6.916 (4.24), 6.931 (2.35), 6.962 (5.18), 7.099 (2.35), 7.114 (4.24), 7.147 (2.35), 7.157 (5.18), 7.171 (3.29), 7.330 (3.29), 7.345 (2.82), 7.590 (4.24), 7.592 (4.24), 7.604 (5.18), 7.606 (4.71), 7.712 (4.24), 7.726 (3.76), 7.729 (4.24), 7.743 (3.29), 8.252 (3.76), 8.254 (4.24), 8.269 (3.76), 8.689 (13.65), 9.070 (2.35), 9.088 (1.88).
684	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.28 min; MS (ES/pos): m/z = 469 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.120 (0.78), -0.007 (5.46), 0.007 (3.90), 0.117 (0.39), 1.520 (12.10), 1.523 (11.71), 1.534 (12.49), 1.538 (11.71), 1.548 (14.05), 1.563 (13.66), 1.866 (16.00), 1.884 (16.00), 2.036 (1.56), 2.176 (1.56), 2.281 (16.00), 2.294 (16.00), 2.362 (1.95), 2.636 (1.56), 3.363 (1.17), 3.853 (1.95), 4.219 (2.34), 4.245 (2.34), 4.252 (2.73), 4.259 (2.34), 4.266 (2.34), 5.248 (2.73), 5.264 (2.34), 6.771 (5.46), 6.786 (5.85), 6.892 (2.73), 6.906 (5.46), 6.924 (5.46), 6.948 (3.51), 7.131 (3.51), 7.138 (3.12), 7.142 (3.90), 7.147 (5.07), 7.169 (2.34), 7.206 (3.90), 7.215 (3.90), 7.221 (2.73), 7.230 (2.73), 7.318 (3.90), 7.333 (3.51), 7.642 (3.51), 7.660 (5.46), 7.678 (3.51), 8.473 (3.12), 8.484 (3.51), 8.492 (3.51), 8.504 (3.12), 8.640 (11.32), 8.643 (10.54), 9.075 (2.73), 9.082 (2.73), 9.092 (2.73), 9.098 (2.73).
685	LC-MS (方法 L1): Rt = 1.18 min; MS (ES/pos): m/z = 423 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.007 (1.56), 0.006 (1.12), 1.861 (5.14), 2.038 (0.49), 2.044 (0.51), 2.052 (0.51), 2.058 (0.54), 2.066 (0.72), 2.072 (0.58), 2.079 (0.42), 2.185 (0.47), 2.195 (0.63), 2.205 (0.63), 2.212 (0.58), 2.297 (7.94), 2.778 (16.00), 4.237 (0.98), 4.243 (0.79), 4.254 (1.52), 4.261 (1.45), 4.268 (0.93), 4.275 (0.98), 5.278 (0.42), 5.290 (0.91), 5.306 (0.89), 5.317 (0.40), 6.779 (1.89), 6.781 (1.96), 6.796 (2.10), 6.798 (2.06), 6.899 (0.84), 6.915 (1.68), 6.929 (0.96), 6.965 (2.03), 7.101 (1.03), 7.116 (1.78), 7.145 (1.00), 7.148 (1.10), 7.157 (2.34), 7.172 (1.31), 7.179 (0.84), 7.335 (1.31), 7.350 (1.19), 7.599 (1.92), 7.602 (1.92), 7.613 (2.36), 7.616 (2.27), 7.714 (1.96), 7.728 (1.78), 7.731 (2.15), 7.745 (1.64), 8.219 (2.08), 8.222 (2.13), 8.236 (1.96), 8.239 (1.82), 8.701 (6.47), 9.043 (1.66), 9.060 (1.66).

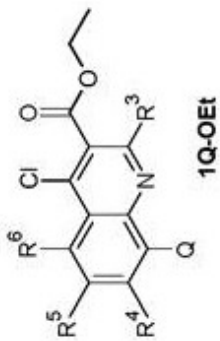
[1961]

686	LC-MS (方法 L1): RI = 1.14 min; MS (ESIpos): m/z = 479 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (600 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 0.005 (1.04), 2.043 (0.47), 2.048 (0.60), 2.053 (0.96), 2.058 (1.04), 2.065 (1.12), 2.069 (1.07), 2.077 (1.37), 2.081 (1.20), 2.087 (2.11), 2.092 (0.63), 2.193 (0.58), 2.199 (0.86), 2.202 (0.81), 2.207 (1.32), 2.213 (0.97), 2.216 (1.31), 2.221 (1.32), 2.230 (0.99), 2.236 (0.64), 2.239 (0.62), 2.244 (0.46), 2.793 (0.55), 3.345 (8.00), 4.220 (0.71), 4.225 (0.87), 4.234 (0.90), 4.239 (2.32), 4.244 (1.61), 4.253 (1.77), 4.258 (1.47), 4.268 (1.42), 4.273 (1.80), 4.279 (1.58), 4.285 (1.91), 4.292 (0.78), 4.298 (0.84), 4.303 (0.65), 5.037 (16.00), 5.287 (0.91), 5.297 (1.95), 5.310 (1.96), 5.320 (0.92), 6.790 (3.66), 6.791 (3.76), 6.803 (4.00), 6.804 (3.99), 6.917 (1.85), 6.918 (1.84), 6.929 (3.75), 6.931 (3.68), 6.942 (2.14), 6.943 (2.05), 7.159 (1.78), 7.161 (1.80), 7.173 (3.01), 7.184 (1.56), 7.187 (1.49), 7.259 (1.51), 7.267 (1.49), 7.274 (1.49), 7.376 (3.08), 7.388 (2.95), 7.609 (0.49), 7.614 (0.63), 7.619 (0.75), 7.624 (1.18), 7.628 (1.14), 7.633 (1.23), 7.638 (1.18), 7.642 (1.18), 7.646 (0.74), 7.651 (0.65), 7.657 (0.56), 7.800 (2.66), 7.812 (3.85), 7.814 (3.18), 7.826 (3.61), 7.873 (4.17), 7.875 (4.29), 7.885 (3.06), 7.887 (2.94), 8.416 (3.61), 8.418 (3.65), 8.430 (3.48), 8.432 (3.27), 8.890 (12.74), 9.184 (3.52), 9.197 (3.43).
687	LC-MS (方法 L1): RI = 1.24 min; MS (ESIpos): m/z = 445 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (500 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.306 (6.83), 1.321 (15.00), 1.336 (6.50), 2.030 (0.50), 2.043 (1.17), 2.050 (1.17), 2.058 (1.17), 2.064 (1.33), 2.072 (6.00), 2.078 (1.33), 2.084 (1.00), 2.091 (0.67), 2.187 (0.67), 2.194 (1.17), 2.205 (1.33), 2.214 (1.33), 2.222 (1.17), 2.234 (0.83), 2.248 (0.50), 2.363 (0.50), 2.637 (0.50), 3.235 (1.83), 3.250 (5.50), 3.265 (5.67), 3.280 (2.50), 3.352 (3.17), 3.358 (2.17), 3.365 (1.17), 3.376 (0.83), 3.429 (0.50), 4.236 (0.83), 4.251 (2.67), 4.261 (2.83), 4.266 (3.50), 4.270 (3.67), 4.274 (3.67), 4.282 (2.33), 4.297 (0.67), 5.298 (1.00), 5.310 (2.17), 5.326 (2.17), 5.337 (1.00), 6.786 (4.17), 6.788 (4.33), 6.802 (4.67), 6.804 (4.50), 6.916 (2.17), 6.918 (2.17), 6.931 (4.33), 6.933 (4.17), 6.945 (2.67), 6.948 (2.50), 7.153 (2.17), 7.156 (2.17), 7.170 (3.50), 7.184 (1.83), 7.187 (1.67), 7.257 (0.83), 7.261 (1.67), 7.266 (1.33), 7.276 (1.67), 7.280 (3.50), 7.285 (2.33), 7.294 (1.00), 7.299 (1.67), 7.304 (1.17), 7.333 (4.67), 7.337 (5.17), 7.350 (8.83), 7.364 (3.83), 7.757 (3.17), 7.771 (4.50), 7.774 (3.83), 7.788 (4.17), 7.888 (5.17), 7.871 (5.17), 7.882 (4.00), 7.885 (3.67), 8.316 (4.00), 8.318 (4.00), 8.333 (3.83), 8.335 (3.50), 8.828 (16.00), 9.103 (3.67), 9.120 (3.67).
688	LC-MS (方法 L1): RI = 1.21 min; MS (ESIpos): m/z = 463 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (600 MHz, DMSO-d ₆): d [ppm] = 9.15 (d, 1H), 8.78 (s, 1H), 8.37 (dd, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.47-7.40 (m, 1H), 7.37-7.31 (m, 2H), 7.17 (t, 1H), 6.93 (t, 1H), 5.33-5.29 (m, 1H), 4.30-4.22 (m, 2H), 3.33-3.20 (m, 2H), 2.24-2.17 (m, 1H), 2.09-2.01 (m, 1H), 1.33 (t, 3H)
695	LC-MS (方法 L1): RI = 1.17 min; MS (ESIpos): m/z = 431 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (600 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.063 (0.84), 2.069 (0.94), 2.074 (0.95), 2.081 (1.08), 2.086 (1.02), 2.209 (1.01), 2.217 (1.02), 2.223 (0.98), 2.231 (0.76), 2.790 (16.00), 4.237 (0.59), 4.250 (1.61), 4.255 (1.39), 4.269 (2.17), 4.275 (1.71), 4.280 (1.46), 4.286 (1.51), 4.299 (0.61), 5.297 (0.70), 5.307 (1.52), 5.319 (1.53), 5.329 (0.70), 5.762 (2.23), 6.793 (2.52), 6.807 (2.70), 6.919 (1.29), 6.932 (2.60), 6.944 (1.48), 7.162 (1.32), 7.174 (2.26), 7.187 (1.14), 7.280 (0.92), 7.295 (1.78), 7.311 (0.98), 7.349 (3.64), 7.358 (5.29), 7.369 (3.11), 7.762 (1.45), 7.774 (2.50), 7.788 (1.76), 7.885 (2.83), 7.897 (2.35), 8.285 (2.53), 8.299 (2.38), 8.841 (5.87), 9.107 (2.25), 9.120 (2.21).

表 3a-3e: 中间体

表 3a

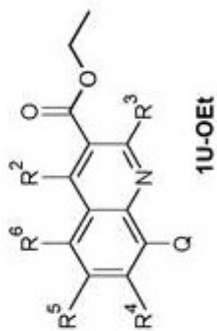
[1962]



编号	R3	R4	R5	R6	Q
1Q-1	H	H	H	H	3,5-二氯苯基
1Q-2	H	H	H	H	2,3,5-三氯苯基
1Q-3	H	H	H	H	2,3-二氯苯基
1Q-4	H	H	H	H	3,5-二氟苯基
1Q-5	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基
1Q-6	H	H	H	H	2,3-二氟苯基
1Q-7	H	F	H	H	3,5-二氯苯基
1Q-8	H	F	H	H	2,3,5-三氯苯基
1Q-9	H	F	H	H	2,3-二氯苯基
1Q-10	H	F	H	H	3,5-二氟苯基
1Q-11	H	F	H	H	2,3,5-三氟苯基
1Q-12	H	F	H	H	2,3-二氟苯基
1Q-13	H	H	H	H	3,5-二甲苯基

表 3b

[1963]

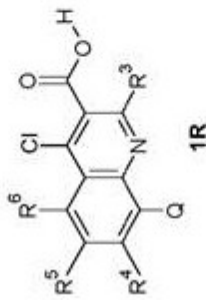


编号	R2	R3	R4	R5	R6	Q
1U-1	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基
1U-2	二甲基氨基	H	H	H	H	2,3,5-三氯苯基
1U-3	二甲基氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基
1U-4	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基
1U-5	二甲基氨基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基
1U-6	二甲基氨基	H	H	H	H	2,3-二氟苯基
1U-7	二甲基氨基	H	F	H	H	3,5-二氯苯基
1U-8	二甲基氨基	H	F	H	H	2,3,5-三氯苯基
1U-9	二甲基氨基	H	F	H	H	2,3-二氯苯基
1U-10	二甲基氨基	H	F	H	H	3,5-二氟苯基
1U-11	二甲基氨基	H	F	H	H	2,3,5-三氟苯基
1U-12	二甲基氨基	H	F	H	H	2,3-二氟苯基
1U-13	咪唑-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基
1U-14	咪唑-4-基	H	H	H	H	2,3,5-三氯苯基
1U-15	咪唑-4-基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基
1U-16	咪唑-4-基	H	H	H	H	3,5-二氟苯基
1U-17	咪唑-4-基	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基
1U-18	咪唑-4-基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基
1U-19	咪唑-4-基	H	F	H	H	3,5-二氯苯基

[1964]

1U-20	咪唑-4-基	H	F	H	H	2,3,5-三氟苯基
1U-21	咪唑-4-基	H	F	H	H	2,3-二氟苯基
1U-22	咪唑-4-基	H	F	H	H	3,5-二氟苯基
1U-23	咪唑-4-基	H	F	H	H	2,3,5-三氟苯基
1U-24	咪唑-4-基	H	F	H	H	2,3-二氟苯基

表 3c

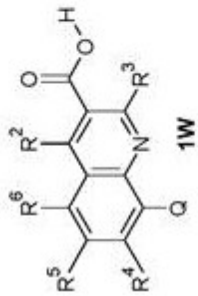


编号	R3	R4	R5	R6	Q
1R-1	H	H	H	H	3,5-二氟苯基
1R-2	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基
1R-3	H	H	H	H	2,3-二氟苯基
1R-4	H	H	H	H	3,5-二氟苯基
1R-5	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基
1R-6	H	H	H	H	2,3-二氟苯基
1R-7	H	F	H	H	3,5-二氟苯基
1R-8	H	F	H	H	2,3,5-三氟苯基
1R-9	H	F	H	H	2,3-二氟苯基
1R-10	H	F	H	H	3,5-二氟苯基

[1965]

1R-11	H	F	H	H	2,3,5-三氟苯基
1R-12	H	F	H	H	2,3-二氟苯基
1R-13	H	H	H	H	3,5-二甲基苯基

表 3d

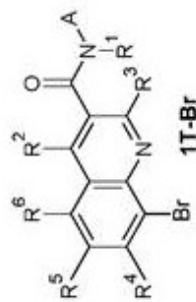


编号	R2	R3	R4	R5	R6	Q
1W-1	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基
1W-2	二甲基氨基	H	H	H	H	2,3,5-三氯苯基
1W-3	二甲基氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基
1W-4	二甲基氨基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基
1W-5	二甲基氨基	H	H	H	H	2,3,5-三氯苯基
1W-6	二甲基氨基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基
1W-7	二甲基氨基	H	F	H	H	3,5-二氯苯基
1W-8	二甲基氨基	H	F	H	H	2,3,5-三氯苯基
1W-9	二甲基氨基	H	F	H	H	2,3-二氯苯基
1W-10	二甲基氨基	H	F	H	H	3,5-二氯苯基
1W-11	二甲基氨基	H	F	H	H	2,3,5-三氯苯基
1W-12	二甲基氨基	H	F	H	H	2,3-二氯苯基
1W-13	吗啉-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基
1W-14	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,3,5-三氯苯基
1W-15	吗啉-4-基	H	H	H	H	2,3-二氯苯基
1W-16	吗啉-4-基	H	H	H	H	3,5-二氯苯基

[1966]

1W-17	咪唑-4-基	H	H	H	H	H	2,3,5-三氟苯基
1W-18	咪唑-4-基	H	H	H	H	H	2,3-二氟苯基
1W-19	咪唑-4-基	H	F	H	H	H	3,5-二氯苯基
1W-20	咪唑-4-基	H	F	F	H	H	2,3,5-三氯苯基
1W-21	咪唑-4-基	H	F	F	H	H	2,3-二氯苯基
1W-22	咪唑-4-基	H	F	F	H	H	3,5-二氯苯基
1W-23	咪唑-4-基	H	F	F	H	H	2,3,5-三氟苯基
1W-24	咪唑-4-基	H	F	F	H	H	2,3-二氟苯基

表 3e



编号	R1	R2	R3	R4	R5	R6	A
1T-1	H	二甲基氨基	H	H	H	H	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
1T-2	H	二甲基氨基	H	H	H	H	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
1T-3	H	二甲基氨基	H	F	H	H	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
1T-4	H	二甲基氨基	H	F	H	H	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
1T-5	H	咪唑-4-基	H	H	H	H	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基
1T-6	H	咪唑-4-基	H	H	H	H	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
1T-7	H	咪唑-4-基	H	F	H	H	(4S)-3,4-二氢-2H-色烯-4-基

[1967]

1T-8	H	吗啉-4-基	H	F	H	H	(1S)-2,3-二氢-1H-茚-1-基
------	---	--------	---	---	---	---	----------------------

表 4: 中间体的 LC-MS 和 NMR 或 NMR 峰值列表

实施例编号	logP (方法 L0) (a)	LC-MS (方法 L1-L5) (方法 L2-L5)	NMR或NMR 峰值列表(peaklist)
1-Q3	5.19		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.100(11.2), 8.521(2.9), 8.516(3.1), 8.501(3.1), 8.496(3.3), 7.983(1.5), 7.965(4.5), 7.945(9.0), 7.941(6.3), 7.928(1.8), 7.756(2.9), 7.736(3.6), 7.732(3.8), 7.504(2.2), 7.485(5.2), 7.465(3.5), 7.434(4.1), 7.431(4.7), 7.415(2.5), 7.412(2.4), 4.454(2.4), 4.436(7.3), 4.418(7.3), 4.400(2.5), 3.321(80.5), 2.891(0.5), 2.731(0.5), 2.672(1.1), 2.502(195.0), 2.329(1.1), 2.075(1.2), 1.387(7.9), 1.369(16.0), 1.351(7.7), 0.146(0.4), 0.000(90.1), -0.150(0.5)
1Q-13		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.43 min; MS (ESIpos): m/z = 340 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 9.13 (s, 1H), 8.42 (dd, 1H), 7.87 - 7.96 (m, 2H), 7.20 (s, 2H), 7.07 (s, 1H), 4.44 (q, 2H), 2.35 (s, 6H), 1.38 (t, 3H).
1U-5	2.40		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-d ₆): δ [ppm] = 8.73 (s, 1H), 8.35 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.72 - 7.69 (t, 1H), 7.61 - 7.58 (m, 1H), 7.24 - 7.22 (m, 1H), 4.41 - 4.35 (q, 2H), 3.09 (s, 6H), 1.36 (t, 3H).
1U-8	4.57		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.857(1.9), 8.703(3.6), 8.425(0.7), 8.409(0.8), 8.401(0.8), 8.386(0.7), 8.305(0.4), 8.290(0.5), 8.281(0.5), 8.266(0.5), 7.967(2.0), 7.961(2.1), 7.687(0.8), 7.664(1.2), 7.647(0.5), 7.641(0.8), 7.626(0.5), 7.623(0.5), 7.603(0.4), 7.586(2.0), 7.580(2.0), 5.758(5.2), 4.420(0.4), 4.403(1.3), 4.391(0.8), 4.385(1.4), 4.374(2.3), 4.367(0.6), 4.356(2.3), 4.338(0.7), 3.326(1.0), 3.094(16.0), 3.071(9.4), 2.514(7.9), 2.509(15.9), 2.505(21.1), 2.500(15.4), 2.496(7.6), 1.382(1.4), 1.364(3.0), 1.357(2.6), 1.346(1.6), 1.339(5.3), 1.321(2.4), 1.299(0.5), 1.269(0.5), 0.008(0.8), 0.000(20.5), -0.008(0.9)
1U-11	2.40		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.730(3.6), 8.348(1.0), 8.345(0.9), 8.327(1.1), 7.828(0.9), 7.813(1.3), 7.725(1.0), 7.707(1.0), 7.704(1.0), 7.686(0.7), 7.607(0.4), 7.601(0.4), 7.594(0.4), 7.586(0.4), 7.581(0.4), 7.243(0.5), 7.233(0.4), 7.221(0.5), 4.407(0.8), 4.390(2.4), 4.372(2.4), 4.354(0.8), 3.327(5.3), 3.089(16.0), 2.509(10.6), 2.505(13.3), 2.501(9.7), 1.397(10.3), 1.372(2.5), 1.355(5.2), 1.337(2.4), 0.008(0.5), 0.000(10.8), -0.009(0.5)

[1968]

1U-13	5.19	LC-MS (方法 1): Rt = 2.36 min; m/z = 431/433 (M+H) ⁺	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.829(5.1); 8.335(1.1); 8.314(1.2); 8.311(1.2); 7.900(1.1); 7.897(1.2); 7.882(1.5); 7.879(1.4); 7.759(1.2); 7.740(1.3); 7.737(1.4); 7.719(0.9); 7.646(16.0); 4.441(0.9); 4.423(3.1); 4.405(3.1); 4.388(1.0); 3.896(2.6); 3.885(3.5); 3.874(2.7); 3.320(6.3); 3.273(2.7); 3.262(3.4); 3.251(2.4); 2.525(0.6); 2.511(14.8); 2.507(30.3); 2.503(39.9); 2.498(28.5); 2.494(13.8); 1.397(6.5); 1.376(7.1); 1.359(3.3); 0.000(3.3)
1U-15	3.90	LC-MS (方法 1): Rt = 2.17 min; m/z = 431/433 (M+H) ⁺	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.726(8.4); 8.345(1.6); 8.337(1.6); 8.327(1.7); 8.320(1.8); 7.768(0.8); 7.751(3.0); 7.740(3.4); 7.733(6.7); 7.723(1.0); 7.713(2.2); 7.709(2.3); 7.693(2.5); 7.689(2.5); 7.468(1.8); 7.448(3.6); 7.429(2.2); 7.369(2.7); 7.366(2.8); 7.350(1.9); 7.347(1.7); 4.427(1.5); 4.409(4.8); 4.391(4.9); 4.373(1.6); 3.899(4.4); 3.887(6.0); 3.876(4.6); 3.321(37.8); 3.293(2.5); 3.282(5.5); 3.270(5.3); 3.259(2.2); 3.239(0.6); 2.671(0.4); 2.506(61.9); 2.502(81.2); 2.488(60.0); 2.329(0.5); 1.397(16.0); 1.380(5.5); 1.362(11.1); 1.344(5.2); 0.008(2.2); 0.000(45.4)
1R-1		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.16 min; MS (ESIpos): m/z = 352 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.008 (1.29), 0.008 (1.20), 1.760 (0.44), 2.329 (0.64), 2.367 (0.44), 2.524 (2.38), 2.671 (0.63), 2.711 (0.43), 3.601 (0.50), 7.654 (1.72), 7.660 (4.30), 7.664 (6.77), 7.669 (16.00), 7.673 (7.64), 7.804 (1.91), 7.823 (3.49), 7.843 (3.22), 7.887 (3.53), 7.890 (3.71), 7.904 (2.79), 8.354 (3.04), 8.357 (3.11), 8.375 (2.85), 8.378 (2.73), 8.907 (6.32).
1R-3		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.05 min; MS (ESIpos): m/z = 352 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 1.175 (0.47), 1.356 (0.45), 1.989 (0.90), 2.074 (8.95), 2.329 (0.81), 2.369 (0.60), 2.671 (0.95), 2.711 (0.65), 2.865 (0.47), 3.092 (0.78), 7.362 (0.70), 7.381 (1.05), 7.409 (6.34), 7.427 (11.32), 7.462 (7.73), 7.481 (11.58), 7.500 (5.55), 7.530 (1.06), 7.550 (0.60), 7.585 (0.87), 7.693 (1.21), 7.728 (9.06), 7.747 (7.85), 7.895 (5.45), 7.911 (13.10), 7.923 (10.39), 7.943 (10.33), 7.961 (4.26), 7.992 (0.98), 8.009 (0.69), 8.448 (0.92), 8.485 (8.46), 8.505 (8.03), 9.072 (16.00), 9.141 (1.24), 14.022 (0.91).
1R-13		LC-MS (方法 L1): Rt = 1.15 min; MS (ESIpos): m/z = 312 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 2.346 (16.00), 7.062 (1.52), 7.189 (3.52), 7.884 (1.52), 7.895 (1.68), 7.902 (3.49), 8.396 (0.99), 8.403 (0.92), 8.414 (0.88), 8.421 (0.87), 9.116 (2.83).
1W-8	2.17		¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.717(3.1); 8.422(0.7); 8.406(0.8); 8.399(0.9); 8.383(0.8); 7.965(2.0); 7.960(2.1); 7.823(0.5); 7.815(0.5); 7.809(0.5); 7.796(0.5); 7.783(0.6); 7.675(0.9); 7.652(1.4); 7.630(0.9); 7.596(2.0); 7.590(2.0); 7.502(0.4); 7.478(0.7); 7.466(1.1); 7.385(0.6); 7.344(0.6); 6.579(0.3); 3.328(75.7); 3.106(16.0); 3.077(0.5); 2.671(0.7); 2.549(1.8); 2.503(106.1); 2.339(0.8); 2.329(0.8); 2.324(0.7); 1.271(0.7); 1.170(2.7); 0.146(0.4); 0.000(76.2); -0.150(0.4)
1W-15	1.86	LC-MS (方法 1): Rt = 1.78 min; m/z = 403/405 (M+H) ⁺ [游离碱的质量]	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 8.449(15.5); 8.278(3.9); 8.275(4.0); 8.257(4.4); 8.254(4.3); 7.688(4.2); 7.684(4.3); 7.668(5.2); 7.664(5.0); 7.603(3.0); 7.586(4.8); 7.565(4.2); 7.502(5.2); 7.499(5.4); 7.484(3.9); 7.481(3.6); 7.447(3.6); 7.428(7.2); 7.408(4.5); 7.343(5.4); 7.339(5.5); 7.324(4.0); 7.320(3.6); 3.823(9.2); 3.812(16.0); 3.801(9.9); 3.601(0.4); 3.353(665.1); 3.325(9.0); 3.314(7.9); 2.672(0.7); 2.508(106.3); 2.503(137.7); 2.499(101.0); 2.330(0.8); 1.759(0.5); 0.000(19.5)

[1969]

1-T1	LC-MS (方法 L1): R _t = 0.73 min; MS (ESIpos): m/z = 426 [M+H] ⁺	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: 3.050 (16.00), 4.241 (0.59), 4.249 (0.48), 4.262 (0.64), 4.268 (0.76), 4.276 (0.62), 4.283 (0.49), 4.292 (0.50), 5.245 (0.56), 5.264 (0.55), 6.794 (0.98), 6.814 (1.10), 6.919 (0.49), 6.938 (1.05), 6.956 (0.61), 7.163 (0.52), 7.181 (0.86), 7.198 (0.40), 7.362 (0.91), 7.381 (0.84), 7.441 (0.75), 7.461 (1.18), 7.481 (0.82), 8.082 (1.07), 8.099 (1.02), 8.159 (1.09), 8.180 (1.03), 8.680 (3.34), 9.095 (0.82), 9.115 (0.80).
1-T5	LC-MS (方法 L1): R _t = 0.92 min; MS (ESI _{neg}): m/z = 466 [M-H] ⁻	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ [ppm]: -0.149 (0.41), -0.008 (4.42), 0.008 (3.18), 2.041 (0.54), 2.048 (0.76), 2.056 (1.13), 2.063 (1.19), 2.076 (1.30), 2.091 (1.80), 2.098 (1.57), 2.106 (1.11), 2.197 (0.74), 2.206 (1.17), 2.218 (1.70), 2.231 (1.59), 2.240 (1.58), 2.253 (1.13), 2.262 (0.74), 2.274 (0.52), 2.327 (0.60), 2.366 (0.49), 2.523 (2.30), 2.669 (0.66), 2.710 (0.48), 3.217 (0.69), 3.228 (1.18), 3.248 (4.71), 3.258 (11.00), 3.269 (11.26), 3.279 (5.00), 3.842 (8.92), 3.853 (14.13), 3.864 (8.07), 4.214 (0.80), 4.221 (1.01), 4.242 (2.68), 4.249 (2.03), 4.263 (2.41), 4.271 (2.08), 4.276 (2.00), 4.286 (2.44), 4.293 (2.07), 4.302 (2.18), 4.314 (0.86), 4.321 (0.96), 4.329 (0.65), 5.245 (1.10), 5.259 (2.45), 5.279 (2.44), 5.292 (1.06), 6.797 (4.29), 6.815 (4.84), 6.927 (2.26), 6.929 (2.16), 6.946 (4.75), 6.964 (2.87), 7.164 (2.33), 7.167 (2.40), 7.185 (3.85), 7.202 (1.91), 7.206 (1.79), 7.385 (4.05), 7.403 (3.77), 7.499 (3.74), 7.518 (5.40), 7.538 (4.06), 8.123 (4.80), 8.125 (5.04), 8.142 (4.71), 8.144 (4.51), 8.197 (4.92), 8.199 (4.64), 8.218 (4.71), 8.753 (16.00), 9.177 (3.99), 9.197 (3.89).
1-T7	2.69	¹ H-NMR(400.0 MHz, d ₆ -DMSO): δ = 9.220(2.1);9.200(2.1);8.789(9.2);8.283(1.8);8.268(1.9);8.260(2.0);8.244(1.9);7.671(2.0);7.650(2.6);7.627(1.8);7.402(2.0);7.385(2.2);7.203(1.1);7.166(2.2);7.169(1.3);7.165(1.3);6.964(1.6);6.945(2.6);6.929(1.3);6.926(1.2);6.819(2.9);6.798(2.7);5.266(0.6);5.272(1.3);5.252(1.3);5.238(0.6);4.329(0.4);4.320(0.5);4.312(0.5);4.301(1.1);4.292(1.1);4.284(1.3);4.276(1.0);4.267(1.1);4.260(1.3);4.246(1.1);4.238(1.4);4.218(0.5);4.211(0.5);3.865(4.4);3.854(7.4);3.843(4.7);3.726(3.9);3.715(4.8);3.703(4.1);3.568(16.0);3.487(0.4);3.332(12.7);3.280(4.6);3.270(7.3);3.259(6.7);3.229(1.2);3.023(3.6);3.011(4.6);2.999(3.4);2.675(0.7);2.671(0.9);2.666(0.7);2.510(6.1);2.506(124.6);2.502(165.2);2.497(119.8);2.329(1.0);2.272(0.4);2.261(0.5);2.250(0.6);2.237(0.9);2.228(0.9);2.215(1.0);2.202(0.7);2.193(0.4);2.103(0.6);2.095(0.8);2.088(1.0);2.071(0.8);2.060(0.7);2.053(0.6);1.470(0.4);0.936(0.4);0.008(1.0);0.000(24.6);-0.008(1.1).

[1970] 实验部分-生物测定

[1971] 实施例在选定的生物测定中测试一次或多次。在测试多于一次时，数据被报告为

平均值或中值,其中,

[1972] ● 平均值也称为算数平均值,表示所获得的值之和除以测试次数,并且

[1973] ● 中值表示以升序或降序排列时值的组的中间数。如果在数据集中的值的数量是奇数,则中值是中间值。如果在数据集中的值的数量是偶数,则中值是两个中间值的算数平均值。

[1974] 实施例合成一次或多次。在合成多于一次时,来自生物测定的数据表示利用由一个或多个合成批次的测试获得的数据集计算的平均值或中值。

[1975] 本发明的化合物的体外活性可以在下述测定中证明:

[1976] 体外测定1:在重组秀丽隐杆线虫(C. elegans)细胞系的秀丽隐杆线虫Slo-1a-作用

[1977] 稳定的秀丽隐杆线虫CHO细胞系的产生

[1978] CHO细胞系由ATCC获得,编号ATCC CRL-9096。为了用质粒DNA转染从而表达秀丽隐杆线虫Slo-1a (登录号AAL28102),在向细胞培养物添加转染溶液前,将CHO细胞传代至40%汇合度。转染溶液包括300 μ L OptiMEM (Life Technologies,Nr.:31985)、2 μ L (= 6 μ g)的含秀丽隐杆线虫 Slo 1a基因的质粒DNA和9 μ L FugeneHD (Promega,Nr.:E2311),并将其添加至细胞,然后在37 $^{\circ}$ C、5% CO₂下温育48小时。将转染培养基交换为含有额外的G418 (2 mg/ml,Invitrogen,Nr.:10131)的选择培养基,并且将细胞接种于384孔板(300个细胞/孔)。数周后,用电压敏感染料(膜电位测定试剂盒 (Membrane Potential Assay Kit),Molecular Devices Nr.:R8034),测试剩余存活细胞的K⁺通道表达。通过有限稀释技术来纯化阳性细胞克隆。为此,将在电压敏感染料测定中具有最高且最强健信号的克隆进一步在384孔板(0.7个细胞/孔)中进行亚克隆(温育),以便获得克隆纯度。这生成了最终稳定的表达秀丽隐杆线虫 Slo-1a的CHO细胞系。

[1979] 细胞培养条件

[1980] 在37 $^{\circ}$ C和5% CO₂下在具有Gutamax I (Invitrogen,Nr.:32571)且补充有10% (v/v)热灭活胎牛血清(Invitrogen,Nr.:10500)、G418 (1 mg/ml,Invitrogen,Nr.:10131)的MEM α 中培养细胞。使用Accutase (Sigma,Nr.:A6964)分离细胞。

[1981] 膜电位测量

[1982] 实验室化合物测试在384孔微量滴定板(MTPs,Greiner,Nr.:781092)上实施。以8000个细胞/孔铺板于384孔MTP上,并在37 $^{\circ}$ C和5% CO₂下培养20至24小时。去除细胞培养基后,将细胞用台氏液(150 mM NaCl、0.3 mM KCl、2 mM CaCl₂、1mM MgCl₂、0.8 mM NaH₂PO₄、5mM 葡萄糖、28 mM Hepes,pH 7.4)洗涤一次,然后在室温下,用在台氏液中稀释的膜电位测定试剂盒的电压敏感染料负载1 h。

[1983] 开始使用FLIPR Tetra (Molecular Devices,Exc. 510-545 nm,Emm. 565-625 nm)测量荧光后,添加测试化合物,接着添加KCl台氏液(最终测定浓度:70 mM KCl、2 mM CaCl₂、1mM MgCl₂、0.8 mM NaH₂PO₄、5mM 葡萄糖、28 mM Hepes,pH 7.4,包括电压敏感染料)。7分钟后完成测量。

[1984] 统计

[1985] 通过使用ActivityBase XLfit软件(IDBS)用于曲线拟合和计算半数最大有效浓度(EC₅₀)来评价数据,并且将其报告为负常用对数(pE₅₀)。

[1986] 对于以下实施例,已发现其 $pE_{50} > 5.3 - 6.5$:27、28、85、87、88、109、131、182、183、243、345、361、363、402、424、440、510、511、521、534、547、555、580、592、599、656。

[1987] 对于以下实施例,已发现其 $pE_{50} > 6.5 - 7.5$:1、62、68、69、71、95、114、120、122、125、129、136、148、185、216、230、241、242、246、264、276、289、299、324、346、354、372、379、389、390、399、401、424、432、439、456、459、474、512、513、514、519、546、560、568、578、581、584、625、632、634、654、665。

[1988] 对于以下实施例,已发现其 $pE_{50} > 7.5 - 8.5$:2、3、4、5、6、23、55、58、63、64、65、66、73、74、90、93、98、102、110、117、119、124、127、128、144、145、147、150、152、154、158、159、163、173、180、188、195、196、203、204、212、213、218、219、224、229、231、232、236、245、252、253、255、257、258、259、263、266、268、269、270、273、280、284、287、288、291、295、297、301、304、308、311、312、317、319、320、321、323、325、342、343、344、348、360、370、375、378、380、381、383、384、385、386、391、392、393、394、397、403、405、412、429、433、434、443、447、454、457、458、460、461、463、464、466、471、472、473、475、476、480、481、482、483、484、486、493、494、495、499、500、501、502、503、507、508、509、515、517、518、522、523、524、525、526、527、528、529、530、531、532、533、535、536、537、538、541、545、550、551、559、561、562、563、566、567、569、570、571、572、573、574、575、577、579、585、590、593、595、597、602、615、619、620、621、622、623、626、630、633、635、640、643、661。

[1989] 对于以下实施例,已发现其 $pE_{50} > 8.5$:7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、24、25、26、29、30、31、32、33、34、35、36、37、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、56、57、60、61、70、72、75、76、77、80、81、82、83、89、100、101、108、112、115、121、130、132、133、134、135、137、138、139、140、141、142、143、146、151、153、155、156、157、160、161、162、164、165、166、167、168、169、170、171、172、174、175、176、177、178、179、181、184、186、187、189、190、191、192、193、194、197、200、201、205、206、207、208、209、210、211、214、215、217、220、221、222、223、225、226、227、228、233、234、235、237、238、239、240、244、247、248、249、250、251、254、256、260、261、262、265、267、271、272、274、275、277、278、279、281、282、283、290、292、293、294、296、298、300、302、305、307、309、310、313、314、315、316、318、322、326、327、328、329、330、331、332、333、334、335、338、339、340、341、349、350、351、352、353、355、356、357、358、359、362、364、365、366、367、368、369、371、373、374、376、377、382、387、388、395、396、398、400、404、406、407、408、409、410、411、413、414、415、416、417、418、419、420、421、422、423、425、426、427、428、429、430、431、435、436、437、438、441、442、444、445、446、448、449、450、451、452、453、455、462、465、467、468、469、470、477、478、479、485、487、488、489、490、491、492、496、497、498、504、505、506、516、517、520、539、540、542、543、544、548、549、552、553、554、556、557、558、564、565、576、582、583、586、587、588、589、591、594、596、598、600、601、603、604、605、606、607、608、609、610、611、612、613、614、616、617、618、624、627、628、629、631、636、637、638、639、641、642、644、645、646、647、648、649、650、651、652、653、655、657、658、659、660、662、663、664、666。

[1990] 体外测定2:巴西日圆线虫(Nippostrongylus brasiliensis) (NIPOBR)

[1991] 用含有100 U/ml青霉素、0.1 mg/ml链霉素和2.5 $\mu\text{g}/\text{ml}$ 两性霉素B的盐水缓冲液洗涤成年巴西日圆线虫。将测试化合物溶解于DMSO,并且在培养基中分别以10 $\mu\text{g}/\text{ml}$ (10

ppm) 和 $1\mu\text{g}/\text{ml}$ (1 ppm) 的最终浓度温育蠕虫。使用等分试样的培养基用于确定相对于阴性对照的乙酰胆碱酯酶活性。测量乙酰胆碱酯酶作为抗蠕虫活性的示值读数的原理被描述于 Rapson 等人 (1986) 和 Rapson 等人 (1987)。

[1992] 对于以下实施例,活性(相比于阴性对照的AChE降低)在 $10\mu\text{g}/\text{ml}$ 高于80%:8、9、11、12、13、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、29、31、32、33、34、35、36、37、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、57、58、59、60、61、62、64、65、66、67、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、81、82、83、87、89、95、100、101、104、108、112、115、116、119、122、123、127、128、130、132、133、134、135、136、137、138、139、141、142、143、144、146、147、148、333、334、336、338、339、340、341、349、362、363、364、373、609、610、611、612、613、614、615、617、618、619、620、623、630。

[1993] 对于以下实施例,活性(相比于阴性对照的AChE降低)在 $1\mu\text{g}/\text{ml}$ 高于80%:8、9、12、13、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、29、31、32、33、34、35、36、37、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、57、58、60、61、65、67、69、70、73、74、75、76、77、80、81、82、83、84、89、92、93、95、100、101、108、112、114、115、116、117、118、119、122、124、125、126、127、128、129、130、132、133、134、135、136、137、138、139、142、143、144、146、149、150、151、152、153、154、155、156、157、158、160、161、162、163、165、166、167、168、169、170、171、172、176、178、181、182、185、186、187、189、190、191、192、193、194、195、197、198、200、201、203、204、205、206、207、208、209、210、211、212、214、215、217、218、220、221、222、223、224、225、226、227、228、229、231、232、233、234、235、236、237、238、239、240、247、249、250、251、254、256、257、260、261、262、263、265、266、268、271、272、273、274、275、276、277、279、280、281、282、283、284、285、287、288、289、290、291、292、293、294、301、302、307、308、309、310、311、313、314、315、318、319、321、322、326、327、328、329、330、331、332、333、334、336、338、339、340、341、342、347、349、350、352、353、355、356、357、358、359、360、362、364、365、367、369、370、373、374、375、377、382、384、385、386、388、392、394、395、396、397、400、403、404、406、407、408、409、410、411、413、414、415、417、418、419、420、421、422、424、425、426、427、428、429、430、431、432、433、434、435、436、437、441、443、444、445、446、447、448、449、450、451、452、453、454、455、458、460、461、462、463、464、465、466、467、468、469、470、471、472、473、476、477、478、479、482、485、486、487、488、490、491、492、495、496、497、498、499、500、501、504、505、506、507、508、509、516、517、520、527、528、529、530、531、532、533、535、536、537、538、540、541、542、543、544、545、548、549、550、551、552、553、554、556、557、558、561、562、563、564、565、566、569、570、571、572、573、574、575、576、577、578、579、581、582、583、585、586、587、588、590、594、596、597、598、601、602、603、604、605、606、607、608、609、610、611、612、613、614、615、617、618、619、620、623、624、626、627、628、629、631、632、633、634、635、636、637、638、639、640、641、642、645、646、647、648、649、650、651、652、653、655、657、658、660。

[1994] 体外测定3:犬恶丝虫微丝蚴(Dirofilaria immitis microfilariae) (DIROIM L1)

[1995] 将从血液中新纯化化的 ≥ 250 只犬恶丝虫微丝蚴添加至含有营养培养基和在DMSO中的测试化合物的微量滴定板的孔中。一式两份地在浓度-响应测定中测试化合物。暴露于

DMSO且没有测试化合物的幼虫被用作阴性对照。在用化合物温育72 h后评价幼虫。效能被确定为与阴性对照相比的能动性的降低。基于宽浓度范围的评价,计算浓度-响应曲线以及 EC_{50} -值。

[1996] 对于以下实施例, $EC_{50} < 0.1$ ppm: 1、4、5、6、7、8、9、10、12、13、15、16、17、22、23、24、25、26、29、30、31、32、33、34、35、36、37、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、50、51、52、53、54、56、57、58、60、61、64、65、69、73、74、76、77、80、81、82、83、84、89、101、103、108、111、112、115、117、119、124、125、127、128、129、130、132、133、134、138、139、140、141、142、143、144、145、146、147、150、151、152、153、154、155、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、172、173、174、175、176、177、178、179、180、181、185、186、187、188、189、190、191、192、194、196、197、200、201、203、204、205、206、207、208、209、210、211、212、214、215、217、218、219、220、221、222、223、224、225、226、227、228、229、231、232、233、234、235、236、237、238、239、240、244、247、248、249、250、251、253、255、256、257、258、259、260、261、262、265、266、267、268、269、270、271、272、273、274、275、276、277、278、279、280、281、283、290、292、293、296、300、303、304、305、306、307、308、309、310、311、312、313、314、315、317、319、322、326、327、329、330、331、332、333、334、338、339、340、340、341、342、344、350、351、352、353、355、356、357、358、359、360、362、364、365、366、367、368、369、373、374、375、376、377、381、382、383、384、385、386、388、390、391、392、394、395、396、400、403、404、405、406、407、408、409、410、411、413、414、415、417、418、419、420、421、422、423、425、426、427、428、429、430、431、433、434、435、436、437、438、441、442、443、444、445、446、447、448、449、450、451、452、453、454、455、457、458、459、460、461、462、463、464、465、466、467、468、469、470、471、472、473、474、475、476、477、478、479、480、482、483、485、486、487、488、490、491、492、493、495、497、498、499、500、501、503、504、505、506、507、508、509、516、517、521、522、523、524、525、527、528、529、530、531、532、533、536、537、538、539、540、541、542、543、544、545、546、547、548、549、550、551、552、553、554、556、557、558、559、560、561、562、563、564、565、566、567、568、569、570、571、572、573、574、575、576、577、578、579、581、582、583、584、586、587、588、589、590、591、594、596、597、598、600、601、602、603、604、605、606、607、608、609、610、611、612、613、614、615、616、617、618、619、620、622、623、624、626、627、628、629、632、633、634、635、636、638、639、641、642、645、646、647、648、649、650、651、652、653、655、657、658、660。

[1997] 对于以下实施例, $EC_{50} < 1$ ppm: 3、11、19、49、55、62、63、66、67、70、71、72、75、86、90、93、94、95、99-1、100、102、104、105、116、135、136、137、148、182、183、184、193、195、199、213、216、230、241、242、243、245、246、252、254、263、282、288、289、291、292、294、295、299、316、320、321、323、325、343、345、348、354、361、370、371、372、373、378、379、380、401、416、424、440、456、580、585、621、630、654。

[1998] 对于以下实施例, $EC_{50} < 10$ ppm: 2、9、13、14、18、20、21、27、28、59、67、68、78、87、88、91、92、96、99-2、106、113、114、118、120、122、123、126、131、149、198、202、264、284、285、286、287、288、301、302、318、324、328、335、336、337、346、347、349、363、387、389、393、397、398、399、402、412、432、439、481、484、485、489、491、492、494、510、511、512、513、514、515、518、519、520、526、534、535、555、595、599、625、631、637、640、643、644、656、659。

[1999] 体外测定4:犬恶丝虫(Dirofilaria immitis) (DIROIM L4)

[2000] 将从其载体(中间宿主)中新鲜分离的10只犬恶丝虫第三期幼虫添加至含有营养培养基和在DMSO中的测试化合物的微量滴定板的孔中。一式两份地在浓度-响应测定中测试化合物。暴露于DMSO且没有测试化合物的幼虫被用作阴性对照。在用化合物温育72 h后评价幼虫。在温育的这72 h内,阴性对照中的大部分幼虫蜕皮至第四期幼虫。效能被确定为与阴性对照相比的能动性的降低。基于宽浓度范围的评价,计算浓度-响应曲线以及EC₅₀-值。

[2001] 对于以下实施例,EC₅₀ < 0.1 ppm: 7、8、9、10、11、12、13、15、16、17、18、19、21、22、23、24、25、26、29、30、31、32、33、34、35、36、37、39、40、41、42、43、44、45、46、47、48、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、69、73、74、75、76、77、81、82、83、89、101、108、112、117、119、124、125、127、130、132、133、134、138、139、140、141、142、143、144、146、151、152、153、154、155、156、157、158、159、160、161、162、163、164、165、166、167、168、169、170、171、172、174、175、176、177、178、179、181、186、190、191、192、194、196、197、200、203、204、205、206、207、208、209、210、211、212、214、215、217、218、220、221、222、223、224、225、226、227、228、229、231、232、233、234、235、236、237、238、239、240、247、248、249、250、251、253、256、257、258、259、260、261、262、265、267、268、271、272、275、277、278、279、280、281、283、290、300、304、309、310、313、314、315、319、322、326、327、330、331、332、333、334、336、338、339、340、341、350、351、352、353、355、356、357、358、359、360、362、365、366、367、374、376、377、382、384、385、386、388、390、392、394、395、396、400、403、404、405、406、407、408、409、410、411、413、414、415、417、418、419、420、421、422、423、425、426、427、429、430、431、433、434、436、437、438、441、442、443、444、446、447、448、449、450、451、452、453、454、455、457、462、463、465、466、467、468、469、470、476、477、478、479、480、482、485、486、487、488、490、491、492、493、495、496、497、498、499、504、505、506、507、516、517、523、525、527、528、529、530、531、532、533、536、537、538、539、540、541、542、543、544、545、548、549、550、551、552、553、554、556、557、558、559、561、562、563、564、565、566、567、568、570、571、572、573、575、576、577、578、579、582、583、584、587、589、590、591、596、597、600、602、603、604、605、606、607、608、609、610、611、612、613、614、615、617、618、619、628、629、635、638、660。

[2002] 对于以下实施例,EC₅₀ < 1 ppm: 1、2、3、14、20、54、80、115、150、201、244、266、364、373。

[2003] 对于以下实施例,EC₅₀ < 10 ppm: 133、187。

[2004] 体外测定5:棉鼠丝虫(litomosoides sigmodontis) (LTMOSI L3)

[2005] 将从被感染的啮齿动物的胸腔中新鲜分离的10只棉鼠丝虫第三期幼虫添加至含有营养培养基和在DMSO中的测试化合物的微量滴定板的孔中。一式两份地在浓度-响应测定中测试化合物。暴露于DMSO且没有测试化合物的幼虫被用作阴性对照。在用化合物温育72 h后评价幼虫。效能被确定为与阴性对照相比的能动性的降低。基于宽浓度范围的评价,计算浓度-响应曲线以及EC₅₀-值。

[2006] 对于以下实施例,EC₅₀ < 0.1 ppm: 8、9、10、12、13、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、29、32、33、34、35、36、37、45、46、48、52、53、54、74、76、77、112、133、134、141、143、

339、341、350、376、382、384、385、386、394、395、396。

[2007] 对于以下实施例, $EC_{50} < 1$ ppm: 3、15、44、73、373。

[2008] 体外测定6:短古柏线虫(*cooperia curticei*) (C00PCU L3)

[2009] 溶剂:二甲基亚砷

[2010] 为了制造适合的活性化合物的制剂,将10 mg的活性化合物溶解于0.5 ml 溶剂,并且将浓度用“林格氏液”稀释至期望浓度。

[2011] 将约40只线虫幼虫(短古柏线虫)转移至含有化合物溶液的测试管中。

[2012] 5天后,记录幼虫死亡率的百分比。100%效能指所有幼虫被杀死;0% 效能指没有幼虫被杀死。

[2013] 在本测试中,例如下述来自制备实施例的化合物在20ppm的施用率下显示出100%的良好活性:8、9、10、13、17、22、23、24、29、32、33、34、36、37、45、46、52、53、57、76、77、81、83、132、133、134、139、143、150、153、155、156、157、166、167、169、170、172、191、192、193、194、195、196、197、200、204、205、206、207、208、209、210、214、215、217、218、221、222、224、226、235、236、237、247、265、266、274、280、300、309、326、327、329、332、341、350、353、356、357、359、373、377、384、385、386、395、396、407、408、410、411、415、419、420、421、426、431、438、445、449、450、451、453、454、455、464、477、479、486、487、488、496、497、504、505、506、507、516、528、529、530、531、532、533、536、537、538、539、541、542、545、551、554、557、558、562、563、564、565、569、572、573、575、576、596、600、603、604、605、607、608、624、628、631、637、638、639、642、647、651、652、655、657、658、659、660。

[2014] 在本测试中,例如下述来自制备实施例的化合物在20ppm的施用率下显示出90%的良好活性:16、31、40、48、50、54、60、80、108、125、142、152、176、178、179、191、201、203、220、223、229、240、251、257、259、260、271、275、276、281、292、314、330、331、333、338、339、358、382、400、406、435、444、446、462、465、467、469、473、476、491、500、509、540、543、548、552、553、601、602、615、640、648。

[2015] 在本测试中,例如下述来自制备实施例的化合物在20ppm的施用率下显示出80%的良好活性:15、21、30、41、42、44、47、49、51、58、65、70、75、89、135、146、154、162、163、181、211、212、228、238、239、250、272、294、298、307、310、315、318、322、328、367、394、404、409、418、424、432、460、471、482、485、490、492、495、508、556、583、587、614、650。

[2016] 在本测试中,例如下述来自制备实施例的化合物在4ppm的施用率下显示出100%的良好活性:8、13、17、22、23、24、32、33、34、36、37、45、46、52、53、57、76、77、81、83、132、133、134、143、151、153、155、167、169、170、172、192、194、195、197、200、205、207、209、210、214、215、217、222、226、237、265、266、273、274、300、309、327、329、332、350、353、359、373、384、385、386、395、395、396、407、408、410、411、415、420、421、426、431、438、445、449、450、451、453、455、477、479、487、488、496、497、499、504、505、529、530、531、532、533、536、539、541、542、545、554、557、558、562、563、564、565、569、572、573、575、576、596、600、604、607、608、628、631、637、638、639、642、647、651、652、655、657、658、659、660。

[2017] 在本测试中,例如下述来自制备实施例的化合物在4ppm的施用率下显示出90%的良好活性:9、29、31、40、54、60、125、139、142、152、156、157、166、191、193、196、208、218、221、223、229、235、236、247、271、275、292、326、330、338、341、356、357、358、419、435、446、

462、464、469、476、500、506、507、540、551、552、601、603、605、648。

[2018] 在本测试中,例如下述来自制备实施例的化合物在4ppm的施用率下显示出80%的良好活性:10、16、39、42、44、47、48、50、51、58、80、108、146、163、171、178、201、203、206、211、212、224、240、258、260、280、281、286、318、333、339、400、406、409、430、437、444、465、467、486、491、508、509、516、528、537、548、583、602、614、624、640。

[2019] 在本测试中,例如下述来自制备实施例的化合物在0.8ppm的施用率下显示出80%的良好活性:190、549。

[2020] 体外测定7:捻转血矛线虫(*Haemonchus contortus*) (HAEMCO L3)

[2021] 溶剂:二甲基亚砜

[2022] 为了制造适合的活性化合物的制剂,将10 mg的活性化合物溶解于0.5 ml 溶剂,并且将浓度用“林格氏液”稀释至期望浓度。

[2023] 将约40只红色胃虫(捻转血矛线虫(*Haemonchus contortus*))的幼虫转移至含有化合物溶液的测试管中。

[2024] 5天后,记录幼虫死亡率的百分比。100%效能指所有幼虫被杀死,0%效能指没有幼虫被杀死。

[2025] 在本测试中,例如下述来自制备实施例的化合物在20ppm的施用率下显示出100%的良好活性:8、13、15、17、22、23、24、29、32、33、34、36、37、46、47、48、50、52、53、57、60、76、77、81、83、132、133、134、135、139、142、143、153、155、166、167、169、170、172、192、194、197、200、205、206、207、214、215、218、221、222、224、226、235、237、247、265、266、274、275、280、300、309、312、326、329、330、331、332、350、353、359、373、377、384、385、386、395、396、407、410、411、415、450、455、477、486、487、488、496、497、504、505、506、509、528、529、530、531、533、537、538、539、541、542、545、551、552、554、558、562、563、564、565、569、572、573、575、576、596、604、605、608、628、631、637、638、647、651、652、655、658、659、660。

[2026] 在本测试中,例如下述来自制备实施例的化合物在20ppm的施用率下显示出90%的良好活性:10、31、44、45、51、74、75、136、146、150、156、179、191、203、204、209、210、217、220、223、229、236、249、250、251、258、260、271、272、327、356、357、358、400、408、421、435、438、444、445、449、451、453、460、469、476、508、532、540、548、553、557、600、602、603、615、640、642、648、657。

[2027] 在本测试中,例如下述来自制备实施例的化合物在20ppm的施用率下显示出80%的良好活性:12、16、39、40、42、70、125、137、138、152、157、176、178、180、208、257、259、273、276、281、292、307、310、333、341、388、392、394、419、420、432、434、446、464、473、479、491、499、500、507、516、535、543、619、624、645、646、650。

[2028] 在本测试中,例如下述来自制备实施例的化合物在4ppm的施用率下显示出100%的良好活性:8、9、13、17、22、23、24、29、32、34、36、37、40、46、52、57、60、76、77、81、132、133、134、139、142、143、153、155、170、192、197、200、205、214、222、237、247、265、266、274、309、330、332、339、350、359、373、384、385、386、395、410、411、455、477、488、496、497、504、509、530、531、539、541、542、545、554、558、562、563、564、565、569、572、573、575、576、596、605、608、628、631、637、639、647、651、652、655、658、659、660。

[2029] 在本测试中,例如下述来自制备实施例的化合物在4ppm的施用率下显示出90%的

良好活性:10、15、31、33、45、47、50、83、135、146、151、166、167、169、191、194、207、209、221、226、229、235、236、271、272、275、300、326、329、353、357、358、396、400、407、408、415、421、435、436、438、445、450、451、476、487、505、508、528、529、533、536、537、540、552、600、603、604、638、640、648。

[2030] 在本测试中,例如下述来自制备实施例的化合物在4ppm的施用率下显示出80%的良好活性:42、44、48、51、53、74、75、150、156、172、195、206、210、215、217、218、223、232、260、281、307、327、341、356、377、392、394、403、419、42、426、444、449、453、469、470、471、479、486、500、506、507、551、557、642、645、650、657。

[2031] 制剂实施例

[2032] 示例性的制剂由在10% 二甘醇单乙醚(Transcutol)、10% 聚氧乙烯蓖麻油(Cremophor EL)和80%等渗盐溶液中的活性物质组成。首先,将活性物质溶解于二甘醇单乙醚。在溶解于二甘醇单乙醚后,添加聚氧乙烯蓖麻油和等渗盐溶液。这些制剂被用作下述体内测定中的服务制剂。

[2033] 根据本发明所述的制剂的实施例是下述制剂实施例F1。其中,将活性物质溶解于二甘醇单乙醚从而形成储备溶液A。然后取0.100 mL的该储备溶液A,并且添加0.100 mL 聚氧乙烯蓖麻油和0.800 mL等渗盐溶液。所得液体制剂(制剂实施例F1)具有1 mL的体积。

[2034] 储备溶液A:

[2035] 4.0 mg 实施例8的化合物;

[2036] 0.1 mL 二甘醇单乙醚。

[2037] 制剂实施例F1:

[2038] 0.100 mL 储备溶液A;

[2039] 0.100 mL 聚氧乙烯蓖麻油;和

[2040] 0.800 mL 等渗盐溶液。

[2041] 体内测定

[2042] 捻转血矛线虫/蛇形毛圆线虫(*Trichostrongylus colubriformis*)/沙鼠

[2043] 在晚期潜伏期将实验性地感染了血矛线虫和/或毛圆线虫的沙鼠处理一次。将测试化合物配制为溶液或混悬剂,并口服或腹膜内应用。对于两种应用,使用相同的服务制剂。应用的体积相当于通常最大为20 ml/kg。例如,具有40 g体重的沙鼠用0.200 mL的制剂实施例F1的制剂处理。这对应于以20 mg/kg体重进行处理。

[2044] 每组效能分别被确定为在尸检后,与感染且安慰剂处理的对照组中的蠕虫计数相比,胃和小肠中蠕虫计数的减少。

[2045] 对下述实施例进行了测试并且其具有在给定处理中 \geq 70%或更高的活性:

[2046]

处理	捻转血矛线虫 (<i>Haemonchus contortus</i>)	蛇形毛圆线虫 (<i>Trichostrongylus colubriformis</i>)
≤2.5 mg/kg 腹膜内	实施例编号 8, 9, 13, 15, 17, 18, 21, 22, 23, 24, 25, 33, 34, 36, 37, 44, 46, 52, 54, 130, 153, 156, 166, 167, 168, 181, 192, 200, 201, 203, 205, 206, 209, 214, 220, 221, 222, 232, 233, 234, 235, 237, 238, 239, 250, 251, 300, 301, 309, 310, 322, 326, 327, 330, 331, 355, 357, 358, 359, 360, 374, 385, 386, 392, 395, 409, 410, 411, 413, 415, 419, 427, 430, 431, 438, 444, 450, 455 462, 465, 467, 468, 477, 485, 487, 491, 492, 496, 516, 530, 533, 538, 540, 543, 548, 553, 557, 558, 564, 565, 660	实施例编号 8, 13, 17, 22, 37, 51, 52, 132, 133, 134, 142, 143, 168, 169, 170, 200, 206, 222, 235, 251, 359, 395, 660