



(12) 发明专利

(10) 授权公告号 CN 104244713 B

(45) 授权公告日 2016. 08. 24

(21) 申请号 201380020923. 7

代理人 王媛 钟守期

(22) 申请日 2013. 02. 18

(51) Int. Cl.

(30) 优先权数据

C07D 261/08(2006. 01)

12156310. 0 2012. 02. 21 EP

C07D 231/20(2006. 01)

C07C 313/06(2006. 01)

(85) PCT国际申请进入国家阶段日

2014. 10. 20

(56) 对比文件

US 20040235793 A1, 2004. 11. 25,

CN 101679284 A, 2010. 03. 24,

CN 102065690 A, 2011. 05. 18,

(86) PCT国际申请的申请数据

PCT/EP2013/053151 2013. 02. 18

(87) PCT国际申请的公布数据

W02013/124230 DE 2013. 08. 29

审查员 梁艳辉

(73) 专利权人 拜耳知识产权有限责任公司

地址 德国蒙海姆

(72) 发明人 H·阿伦斯 S·多尔纳-里平

S·莱尔 H·迪特里希

E·加茨魏勒 C·H·罗辛格

D·施姆茨勒

(74) 专利代理机构 北京北翔知识产权代理有限

公司 11285

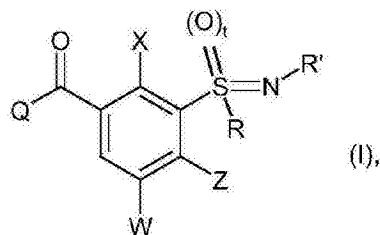
权利要求书2页 说明书152页

(54) 发明名称

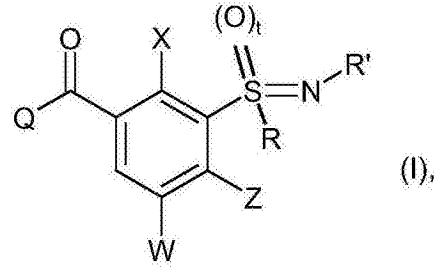
除草的亚磺酰亚氨酰基苯甲酰基衍生物和磺酰亚氨酰基苯甲酰基衍生物

(57) 摘要

本发明涉及通式 (I) 的亚磺酰亚氨酰基苯甲酰基衍生物和磺酰亚氨酰基苯甲酰基衍生物。在所述式 (I) 中, R、R'、X、W 和 Z 代表基团例如氢, 有机基团如烷基, 和其他基团如卤素。Q 代表环己二酮基、吡啶基或异噁唑基。

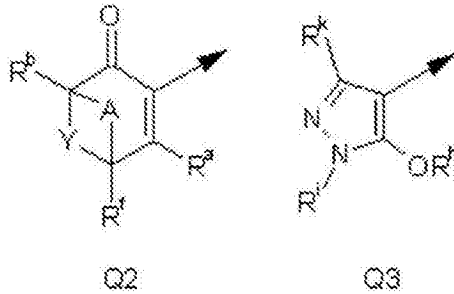


1. 式(I)的亚磺酰亚氨基苯甲酰基衍生物和磺酰亚氨基苯甲酰基衍生物或其盐



其中,

Q为基团Q2或Q3,



R^a为羟基,

R^b和R^f各自独立地为氢,

R^h为氢,

Rⁱ为(C₁-C₄)-烷基,

R^k为氢、(C₁-C₄)-烷基,

A和Y各自独立地为(C₁-C₄)-亚烷基,

X为R¹0,

Z为卤代-(C₁-C₆)-烷基,

W为氢,

R为(C₁-C₆)-烷基,

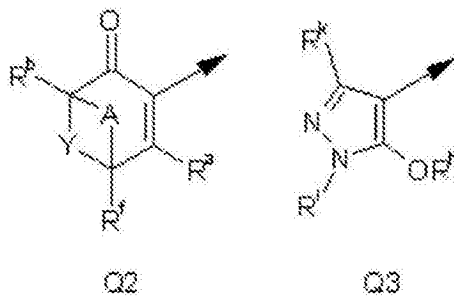
R'为氰基,

R¹为(C₁-C₆)-烷基,

t为0或1。

2. 权利要求1的亚磺酰亚氨基苯甲酰基衍生物和磺酰亚氨基苯甲酰基衍生物,其中

Q为基团Q2或Q3,



R^a为羟基,

R^b 和 R^f 各自独立地为氢，
 R^h 为氢，
 R^i 为甲基或乙基，
 R^k 为氢或甲基，
 A和Y各自独立地为 CH_2 或 CH_2CH_2 ，
 X为甲氧基，
 Z为三氟甲基，
 W为氢，
 R为甲基，
 R' 为氰基，
 t为0或1。

3. 一种除草剂组合物，其包含除草活性量的至少一种权利要求1或2的式(I)的化合物。

4. 权利要求3的除草剂组合物，其与制剂助剂混合。

5. 权利要求3或4的除草剂组合物，其还包含至少一种选自如下的其他活性化合物：杀虫剂、杀螨剂、除草剂、杀菌剂、安全剂和生长调节剂。

6. 权利要求5的除草剂组合物，其包含一种安全剂。

7. 权利要求6的除草剂组合物，其包含环丙磺酰胺、解草酯、吡唑解草酯或双苯噁唑酸。

8. 权利要求6或7的除草剂组合物，其包含另一种除草剂。

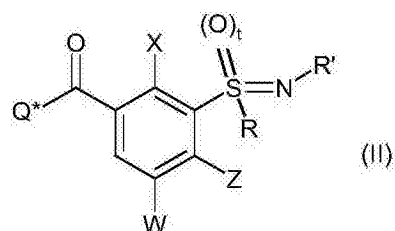
9. 一种防治不想要的植物的方法，其包括向植物或不想要的植物生长位置施用有效量的至少一种权利要求1或2的式(I)的化合物或权利要求3至8中任一项的除草剂组合物。

10. 权利要求1或2的式(I)的化合物或权利要求3至8中任一项所述的除草剂组合物用于防治不想要的植物的用途。

11. 权利要求10的用途，其中式(I)的化合物用于防治有用植物作物中不想要的植物。

12. 权利要求11的用途，其中有用植物是转基因有用植物。

13. 式(II)的化合物



其中， Q^* 为羟基、乙氧基、甲氧基或氯， R 、 R' 、 X 、 W 、 Z 和 t 的含义如权利要求1或2所限定。

14. 权利要求13的式(II)的化合物用于制备权利要求1或2的式(I)的化合物的用途。

除草的亚磺酰亚氨基苯甲酰基衍生物和磺酰亚氨基苯甲酰基衍生物

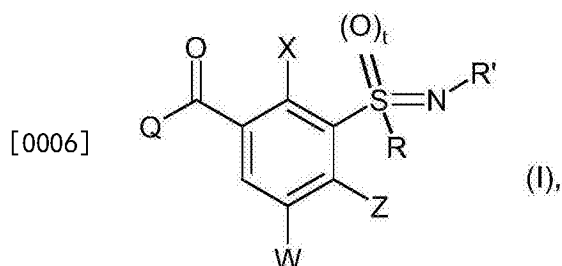
[0001] 本发明涉及的技术领域为除草剂,具体涉及用于选择性防治有用植物作物中的阔叶杂草和禾本科杂草(weed grass)的除草剂的技术领域。

[0002] WO 03/014071 A1和WO 2011/012247 A1公开了具有除草活性的苯甲酰环己二酮,其在苯基环的3位上带有烷基硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基。具有除草活性的在苯基环的3位上带有烷基硫基、烷基亚磺酰基或烷基磺酰基的苯甲酰基吡啶已知于WO 2008/125214 A1和WO 2009/149806 A2。US 2011/0144345 A1和WO 2004/052849 A1各自公开了在苯基环的3位上带有亚磺酰亚氨基的苯甲酰基衍生物。然而,这些出版物中所提及的化合物的除草活性或/和作物相容性往往是不够的。

[0003] 本发明的目的是提供与现有技术已知的化合物相比具有改善的特性的除草活性化合物。

[0004] 现已发现,在苯基环的3位上带有亚磺酰亚氨基(sulfinimidoyl)和磺酰亚氨基(sulfonimidoyl)的苯甲酰基衍生物特别适合作为除草剂。

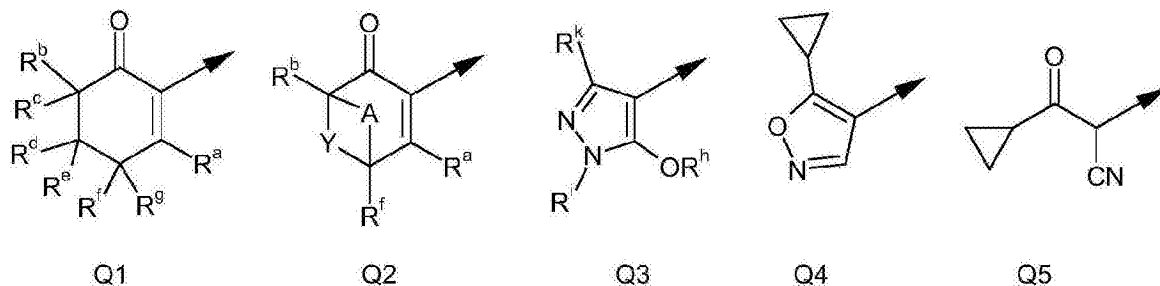
[0005] 因此,本发明提供了式(I)的亚磺酰亚氨基苯甲酰基衍生物和磺酰亚氨基苯甲酰基衍生物及其盐



[0007] 其中,符号和标引具有以下意义:

[0008] Q为基团Q1、Q2、Q3、Q4或Q5,

[0009]



[0010] R^a为羟基、R⁶S、R⁷(R⁸)N,

[0011] R^b、R^c、R^f和R^g各自彼此独立地为氢或(C₁-C₄)-烷基,

[0012] R^d、R^e各自彼此独立地为氢或(C₁-C₄)-烷基或与其连接的碳原子一起形成羰基,

[0013] R^h为氢、(C₁-C₆)-烷基磺酰基、(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₆)-烷基磺酰基、苯磺酰基、苯硫基-2-磺酰基(thiophenyl-2-sulfonyl)、苯甲酰基、苯甲酰基-(C₁-C₆)-烷基、苄基,其中最后提到的5个基团可以任选被卤素、(C₁-C₄)-烷基或(C₁-C₄)-烷氧基单取代或多取代,

[0014] R^1 为(C₁-C₄)-烷基,

[0015] R^k 为氢、(C₁-C₄)-烷基、(C₃-C₇)-环烷基,

[0016] A和Y各自独立地为氧、S(O)_n、N(R³)、羰基或(C₁-C₄)-亚烷基,所述(C₁-C₄)-亚烷基可被n个R⁹基团取代,且被选自氧、S(O)_n、N(R³)和羰基的n个元素间隔,

[0017] X为硝基、卤素、氰基、氰硫基(thiocyanato)、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、卤代-(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、卤代-(C₃-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烯基、卤代-(C₃-C₆)-环烯基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烯基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烯基-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)C、R¹(R¹ON=)C、R¹O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R¹(R¹O)N(O)C、(R¹)₂N(R¹)N(O)C、R¹(O)C(R¹)N(O)C、R²O(O)C(R¹)N(O)C、(R¹)₂N(O)C(R¹)N(O)C、R²(O)₂S(R¹)N(O)C、R¹O(O)₂S(R¹)N(O)C、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N(O)C、R¹O、R¹(O)CO、R²(O)₂SO、R²O(O)CO、(R¹)₂N(O)CO、(R¹)₂N、R¹(O)C(R¹)N、R²(O)₂S(R¹)N、R²O(O)C(R¹)N、(R¹)₂N(O)C(R¹)N、R¹O(O)₂S(R¹)N、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N、R²(O)_nS、R¹O(O)₂S、(R¹)₂N(O)₂S、R¹(O)C(R¹)N(O)₂S、R²O(O)C(R¹)N(O)₂S、(R¹)₂N(O)C(R¹)N(O)₂S、(R⁵O)₂(O)P、R¹(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R¹O(O)C-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、(R¹O)(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)C(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R²O(O)C(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)C(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R²(O)₂S(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R¹O(O)₂S(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、NC-(C₁-C₆)-烷基、R¹O-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)CO-(C₁-C₆)-烷基、R²(O)₂SO-(C₁-C₆)-烷基、R²O(O)CO-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)CO-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)C(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、R²(O)₂S(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、R²O(O)C(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)C(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、R¹O(O)₂S(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、R²(O)_nS-(C₁-C₆)-烷基、R¹O(O)₂S-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)₂S-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)C(R¹)N(O)₂S-(C₁-C₆)-烷基、R²O(O)C(R¹)N(O)₂S-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)C(R¹)N(O)₂S-(C₁-C₆)-烷基、(R⁵O)₂(O)P-(C₁-C₆)-烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-(C₁-C₆)-烷基、杂环基-(C₁-C₆)-烷基,其中最后提到的6个基团各自被s个选自硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、R¹O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R¹O、(R¹)₂N、R²(O)_nS、R¹O(O)₂S、(R¹)₂N(O)₂S和R¹O-(C₁-C₆)-烷基的基团取代,且其中杂环基带有n个氧代基团,

[0018] Z为氢、硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、卤代-(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、卤代-(C₃-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烯基、卤代-(C₃-C₆)-环烯基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烯基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烯基-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)C、R¹(R¹ON=)C、R¹O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R¹(R¹O)N(O)C、(R¹)₂N(R¹)N(O)C、R¹(O)C(R¹)N(O)C、R²O(O)C(R¹)N(O)C、(R¹)₂N(O)C(R¹)N(O)C、R²(O)₂S(R¹)N(O)C、R¹O(O)₂S(R¹)N(O)C、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N(O)C、R¹O、R¹(O)CO、R²(O)₂SO、R²O(O)CO、(R¹)₂N(O)CO、(R¹)₂N、R¹(O)C(R¹)N、R²(O)₂S(R¹)N、R²O(O)C(R¹)N、(R¹)₂N(O)C(R¹)N、R¹O(O)₂S(R¹)N、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N、R²(O)_nS、R¹O(O)₂S、(R¹)₂N(O)₂S、R¹(O)C(R¹)N(O)₂S、R²O(O)C(R¹)N(O)₂S、(R¹)₂N(O)C(R¹)N(O)₂S、(R⁵O)₂(O)P、R¹(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R¹O(O)C-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、(R¹O)(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)C(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R²O(O)C(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、

(O)C(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)C(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R²(O)₂S(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、R¹O(O)₂S(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N(O)C-(C₁-C₆)-烷基、NC-(C₁-C₆)-烷基、R¹O-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)CO-(C₁-C₆)-烷基、R²(O)₂SO-(C₁-C₆)-烷基、R²O(O)CO-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)CO-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)C(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、R²(O)₂S(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、R²O(O)C(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)C(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、R¹O(O)₂S(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N-(C₁-C₆)-烷基、R²(O)_nS-(C₁-C₆)-烷基、R¹O(O)₂S-(C₁-C₆)-烷基、(R¹)₂N(O)₂S-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)C(R¹)N(O)₂S-(C₁-C₆)-烷基、R²O(O)C(R¹)N(O)₂S-(C₁-C₆)-烷基、(R⁵O)₂(O)P-(C₁-C₆)-烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-(C₁-C₆)-烷基、杂环基-(C₁-C₆)-烷基，其中最后提到的6个基团各自被s个选自硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、R¹O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R¹O、(R¹)₂N、R²(O)_nS、R¹O(O)₂S、(R¹)₂N(O)₂S和R¹O-(C₁-C₆)-烷基的基团取代，且其中杂环基带有n个氧代基团，

[0019] W为氢、卤素、硝基、氰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、卤代-(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、卤代-(C₃-C₆)-炔基、(C₃-C₇)-环烷基、卤代-(C₃-C₇)-环烷基、(C₁-C₆)-烷氧基、卤代-(C₁-C₆)-烷氧基、(C₁-C₆)-烷基-(O)_nS-、(C₁-C₆)-卤代烷基-(O)_nS-、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₆)-烷氧基-(C₁-C₄)-卤代烷基、R¹(O)C、R¹(R¹ON=)C、R¹O(O)C、(R¹)₂N、R¹(O)C(R¹)N或R²(O)₂S(R¹)N，

[0020] R为(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基或(C₂-C₆)-炔基，其各自被s个选自硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₃-C₆)-环烷基、R¹(O)C、R¹(R¹ON=)C、R¹O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R¹(R¹O)N(O)C、R²(O)₂S(R¹)N(O)C、R¹O(O)₂S(R¹)N(O)C、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N(O)C、R¹S(O)C、R¹O、R¹(O)CO、R²(O)₂SO、R²O(O)CO、(R¹)₂N(O)CO、(R¹)₂N、R¹O(R¹)N、R¹(O)C(R¹)N、R²(O)₂S(R¹)N、R²O(O)C(R¹)N、(R¹)₂N(O)C(R¹)N、R¹O(O)₂S(R¹)N、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N、R²(O)_nS、R¹C(O)S、R¹O(O)₂S、(R¹)₂N(O)₂S、R¹(O)C(R¹)N(O)₂S、R²O(O)C(R¹)N(O)₂S、(R¹)₂N(O)C(R¹)N(O)₂S和(R⁵O)₂(O)P的基团取代，或者

[0021] 为(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烯基、苯基、苯基-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基、杂芳基-(C₁-C₆)-烷基、杂环基、杂环基-(C₁-C₆)-烷基、苯基-O-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-O-(C₁-C₆)-烷基、杂环基-O-(C₁-C₆)-烷基、苯基-N(R¹)-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-N(R¹)-(C₁-C₆)-烷基、杂环基-N(R¹)-(C₁-C₆)-烷基、苯基-S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基或杂环基-S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基，其各自的环状部分被s个选自硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、R¹(O)C、R¹(R¹ON=)C、R¹O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R¹(R¹O)N(O)C、R²(O)₂S(R¹)N(O)C、R¹O(O)₂S(R¹)N(O)C、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N(O)C、R¹S(O)C、R¹O、R¹(O)CO、R²(O)₂SO、R²O(O)CO、(R¹)₂N(O)CO、(R¹)₂N、R¹O(R¹)N、R¹(O)C(R¹)N、R²(O)₂S(R¹)N、R²O(O)C(R¹)N、(R¹)₂N(O)C(R¹)N、R¹O(O)₂S(R¹)N、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N、R²(O)_nS、R¹C(O)S、R¹O(O)₂S、(R¹)₂N(O)₂S、R¹(O)C(R¹)N(O)₂S、R²O(O)C(R¹)N(O)₂S、(R¹)₂N(O)C(R¹)N(O)₂S、(R⁵O)₂(O)P和R¹O-(C₁-C₆)-烷基的基团取代，且其中杂环基带有n个氧代基团，

[0022] R'为氢、硝基、卤素、氰基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-烯基、卤代-(C₃-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、卤代-(C₃-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)C、R²O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R²S(O)C、(R¹)₂N(S)C、R¹(R¹O)N(O)C、R²(O)₂S(R¹)N(O)C、(R¹)₂N(O)₂S(R¹)N(O)C、R¹O、

$(R^1)_2N$ 、 $R^2(O)_nS$ 、 $(R^2)_3Si$ -(C₁-C₆)-烷基-(O)_nS、 $R^1O(O)_2S$ 、 $(R^1)_2N(O)_2S$ 、 $R^1(O)C(R^1)N(O)_2S$ 、 $R^2O(O)C(R^1)N(O)_2S$ 、 $(R^1)_2N(O)C(R^1)N(O)_2S$ 、 $R^2(O)_2S(R^1)N(O)_2S$ 、 $(R^5O)_2(O)P$ 、 $(R^2)_3Si$ 、 $R^1(O)C$ -(C₁-C₆)-烷基、 $R^1O(O)C$ -(C₁-C₆)-烷基、 $(R^1)_2N(O)C$ -(C₁-C₆)-烷基、 $(R^1O)(R^1)N(O)C$ -(C₁-C₆)-烷基、 $R^2(O)_2S(R^1)N(O)C$ -(C₁-C₆)-烷基、 $R^1O(O)_2S(R^1)N(O)C$ -(C₁-C₆)-烷基、 $(R^1)_2N(O)_2S(R^1)N(O)C$ -(C₁-C₆)-烷基、 R^1O -(C₁-C₆)-烷基、 $R^1(O)CO$ -(C₁-C₆)-烷基、 $R^2(O)_2SO$ -(C₁-C₆)-烷基、 $R^2O(O)CO$ -(C₁-C₆)-烷基、 $(R^1)_2N(O)CO$ -(C₁-C₆)-烷基、 $(R^1)_2N$ -(C₁-C₆)-烷基、 $R^1(O)C(R^1)N$ -(C₁-C₆)-烷基、 $R^2(O)_2S(R^1)N$ -(C₁-C₆)-烷基、 $R^2O(O)C(R^1)N$ -(C₁-C₆)-烷基、 $(R^1)_2N(O)C(R^1)N$ -(C₁-C₆)-烷基、 $R^1O(O)_2S(R^1)N$ -(C₁-C₆)-烷基、 $(R^1)_2N(O)_2S(R^1)N$ -(C₁-C₆)-烷基、 $R^2(O)_nS$ -(C₁-C₆)-烷基、 $R^1O(O)_2S$ -(C₁-C₆)-烷基、 $(R^1)_2N(O)_2S$ -(C₁-C₆)-烷基、 $R^1(O)C(R^1)N(O)_2S$ -(C₁-C₆)-烷基、 $R^2O(O)C(R^1)N(O)_2S$ -(C₁-C₆)-烷基、 $(R^1)_2N(O)C(R^1)N(O)_2S$ -(C₁-C₆)-烷基、 $(R^5O)_2(O)P$ -(C₁-C₆)-烷基、 $(R^2)_3Si$ -(C₁-C₆)-烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-(C₁-C₆)-烷基、杂环基-(C₁-C₆)-烷基,其中上述6个苯基、杂芳基和杂环基的环状部分被s个选自硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、 $R^1O(O)C$ 、 $(R^1)_2N(O)C$ 、 R^1O 、 $(R^1)_2N$ 、 $R^2(O)_nS$ 、 $R^1O(O)_2S$ 、 $(R^1)_2N(O)_2S$ 和 R^1O -(C₁-C₆)-烷基的基团取代,且其中杂环基带有n个氧代基团,

[0023] R^1 为氢、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、卤代-(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、卤代-(C₃-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烯基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基-O-(C₁-C₆)-烷基、环烷基-(C₁-C₆)-烷基-O-(C₁-C₆)-烷基、苯基、苯基-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基、杂芳基-(C₁-C₆)-烷基、杂环基、杂环基-(C₁-C₆)-烷基、苯基-O-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-O-(C₁-C₆)-烷基、杂环基-O-(C₁-C₆)-烷基、苯基-N(R³)-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-N(R³)-(C₁-C₆)-烷基、杂环基-N(R³)-(C₁-C₆)-烷基、苯基-S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、杂环基-S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基,其中最后提到的15个基团各自被s个选自硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、 $R^3O(O)C$ 、 $(R^3)_2N(O)C$ 、 R^3O 、 $(R^3)_2N$ 、 $R^4(O)_nS$ 、 $R^3O(O)_2S$ 、 $(R^3)_2N(O)_2S$ 和 R^3O -(C₁-C₆)-烷基的基团取代,且其中杂环基带有n个氧代基团,

[0024] R^2 为(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、卤代-(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、卤代-(C₃-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烯基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、(C₁-C₆)-烷基-O-(C₁-C₆)-烷基、环烷基-(C₁-C₆)-烷基-O-(C₁-C₆)-烷基、苯基、苯基-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基、杂芳基-(C₁-C₆)-烷基、杂环基、杂环基-(C₁-C₆)-烷基、苯基-O-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-O-(C₁-C₆)-烷基、杂环基-O-(C₁-C₆)-烷基、苯基-N(R³)-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-N(R³)-(C₁-C₆)-烷基、杂环基-N(R³)-(C₁-C₆)-烷基、苯基-S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、杂芳基-S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基、杂环基-S(O)_n-(C₁-C₆)-烷基,其中最后提到的15个基团各自被s个选自硝基、卤素、氰基、氰硫基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、 $R^3O(O)C$ 、 $(R^3)_2N(O)C$ 、 R^3O 、 $(R^3)_2N$ 、 $R^4(O)_nS$ 、 $R^3O(O)_2S$ 、 $(R^3)_2N(O)_2S$ 和 R^3O -(C₁-C₆)-烷基,且其中杂环基带有n个氧代基团,

[0025] R^3 为氢、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基或苯基,

[0026] R^4 为(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基或苯基,

[0027] R^5 为氢或(C₁-C₄)-烷基,

[0028] R^6 为(C₁-C₄)-烷基或为苯基,所述苯基被m个选自卤素、硝基、氰基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基和(C₁-C₄)-卤代烷氧基的基团取代,

[0029] R^7 为氢、(C₁-C₄)-烷基或(C₁-C₄)-烷氧基,

[0030] R^8 为氢或(C₁-C₄)-烷基,

[0031] 或者

[0032] R^7 和 R^8 与其连接的氮原子一起形成5元或6元的饱和、部分饱和或不饱和的环,其另外含有n个选自氮、氧和硫的杂原子,且其可被m个选自卤素、氰基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基和(C₁-C₄)-卤代烷氧基的基团取代,

[0033] R^9 为卤素、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤代烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤代烷氧基或(C₁-C₄)-烷氧基-(C₁-C₄)-烷基,

[0034] m为0、1、2、3、4或5,

[0035] n为0、1或2,

[0036] s为0、1、2或3,

[0037] t为0或1。

[0038] 在式(I)和下面给出的所有式中,具有两个以上碳原子的烷基基团可以是直链或支链的。烷基基团为例如甲基、乙基、正丙基或异丙基、正丁基、异丁基、叔丁基或2-丁基、戊基、己基如正己基、异己基和1,3-二甲基丁基。类似地,烯基为例如烯丙基、1-甲基-丙-2-烯-1-基、2-甲基-丙-2-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、丁-3-烯-1-基、1-甲基-丁-3-烯-1-基和1-甲基-丁-2-烯-1-基。炔基为例如炔丙基、丁-2-炔-1-基、丁-3-炔-1-基、1-甲基丁-3-炔-1-基。在每种情况下,多重键可以位于不饱和基团的任意位置。环烷基为具有3至6个碳原子的饱和碳环体系,例如,环丙基、环丁基、环戊基或环己基。类似地,环烯基为具有3至6个碳环成员的单环烯基,例如,环丙烯基、环丁烯基、环戊烯基和环己烯基,其中双键可以位于任意位置。

[0039] 卤素为氟、氯、溴或碘。

[0040] 杂环基为含有3至6个环原子的饱和的、部分饱和或完全不饱和的环状基团,其中1至4个环原子选自氧、氮和硫,且其可以另外与苯并环进行稠合。杂环基为例如哌啶基、吡咯烷基、四氢呋喃基、二氢呋喃基和氧杂环丁烷基(oxetanyl),

[0041] 杂芳基为含有3至6个环原子的芳香族环状基团,其中1至4个环原子选自氧、氮和硫,且其可以另外与苯并环进行稠合。杂芳基为例如苯并咪唑-2-基、呋喃基、咪唑基、异噁唑基、异噻唑基、噁唑基、吡嗪基、嘧啶基、哒嗪基、吡啶基、苯并异噁唑基、噻唑基、吡咯基、吡唑基、苯硫基、1,2,3-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,4-三唑基、1,2,3-三唑基、1,2,5-三唑基、1,3,4-三唑基、1,2,4-三唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、2H-1,2,3,4-四唑基、1H-1,2,3,4-四唑基、1,2,3,4-噁三唑基、1,2,3,5-噁三唑基、1,2,3,4-噻三唑基和1,2,3,5-噻三唑基。

[0042] 如果一个基团被多个基团取代,则表示这个基团被一个或更多个相同或不同的上述基团取代。这类似地适用于由不同的原子和元素构建的环体系。此处,本领域技术人员已知的在标准温度和压力条件下化学不稳定的化合物被排除在权利要求之外。

[0043] 根据取代基的性质和连接方式,式(I)的化合物可作为立体异构体存在。如果存在

例如一个或更多个不对称取代的碳原子,则可能出现对映异构体和非对映异构体。当基团S(O)_n中的n为1时(亚砷),也会出现立体异构体。另外,亚砷亚胺基(sulfoximino)基团和硫亚胺基(sulfilimino)基团中的硫原子是手性中心。立体异构体可由在制备过程中获得的混合物通过常规的分选方法例如通过色谱分离过程获得。还可使用具有光学活性的起始物质和/或助剂通过立体选择性反应选择性地制备立体异构体。本发明还涉及式(I)所涵盖的但没有示出其具体立体结构的所有立体异构体,及其混合物。

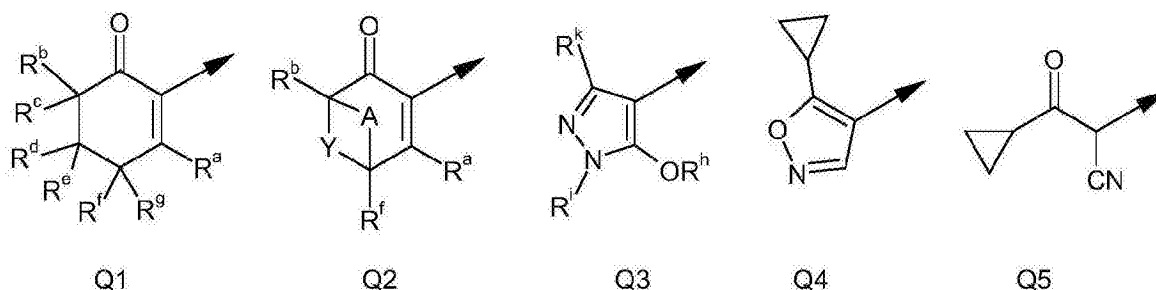
[0044] 式(I)的化合物能够形成盐。可通过使碱作用于具有酸性氢原子的式(I)的化合物——例如在R^a为羟基或R^h为氢的情况下——而形成盐。合适的碱为例如有机胺,如三烷基胺、吗啉、哌啶或吡啶,以及铵、碱金属或碱土金属氢氧化物、碳酸盐和碳酸氢盐,尤其是氢氧化钠和氢氧化钾、碳酸钠、碳酸钾和碳酸氢钠和碳酸氢钾。这些盐为酸性氢被农业上合适的阳离子替代的化合物,例如金属盐,尤其是碱金属盐或碱土金属盐,特别是钠盐和钾盐,或铵盐,与有机胺形成的盐或季铵盐,所述季铵盐为例如具有式[NRR*R**R***]⁺阳离子的盐,其中R、R*、R**和R***各自彼此独立地表示有机基团,尤其是烷基、芳基、芳烷基或烷基芳基。合适的还有烷基磺盐(alkylsulfonium)和烷基氧化磺盐(alkylsulfoxonium),如(C₁-C₄)-三烷基磺盐和(C₁-C₄)-三烷基氧化磺盐。

[0045] 通过与合适的无机酸或有机酸在碱性基团处形成加成物,式(I)的化合物可以形成盐,所述无机酸为例如HCl、HBr、H₂SO₄、H₃PO₄或HNO₃,所述有机酸为例如羧酸如甲酸、乙酸、丙酸、草酸、乳酸或水杨酸,或磺酸如对甲基苯磺酸,所述碱性基团为例如氨基、烷基氨基、二烷基氨基、哌啶基、吗啉基或吡啶基。在这种情况下,这些盐包含酸的共轭碱作为阴离子。

[0046] 优选式(I)的化合物,其中

[0047] Q为基团Q1、Q2、Q3、Q4或Q5,

[0048]



[0049] R^a为羟基,

[0050] R^b、R^c、R^f和R^g各自彼此独立地为氢或(C₁-C₄)-烷基,

[0051] R^d、R^e各自彼此独立地为氢或(C₁-C₄)-烷基或与其连接的碳原子一起形成羰基,

[0052] R^h为氢,

[0053] Rⁱ为(C₁-C₄)-烷基,

[0054] R^k为氢、(C₁-C₄)-烷基、(C₃-C₇)-环烷基,

[0055] A和Y各自彼此独立地为氧或(C₁-C₄)-亚烷基,所述(C₁-C₄)-亚烷基可被n个R^g基团取代,

[0056] X为硝基、卤素、氰基、(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₁-C₆)-烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基、(C₃-C₆)-环烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基、(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、卤代-(C₃-C₆)-环烷基-(C₁-C₆)-烷基、R¹(O)C、R¹(R¹ON=)C、R¹O(O)C、(R¹)₂N(O)C、R¹O、(R¹)₂N、R¹(O)C(R¹)N、

$R^2(O)_2S(R^1)N$ 、 $R^2O(O)C(R^1)N$ 、 $(R^1)_2N(O)C(R^1)N$ 、 $R^2(O)_nS$ 、 $R^1O(O)_2S$ 、 $(R^1)_2N(O)_2S$ 、 $(R^5O)_2(O)P$ 、 $R^1(O)C-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^1O(O)C-(C_1-C_6)$ -烷基、 $(R^1)_2N(O)C-(C_1-C_6)$ -烷基、 $NC-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^1O-(C_1-C_6)$ -烷基、 $(R^1)_2N-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^1(O)C(R^1)N-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^2(O)_2S(R^1)N-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^2O(O)C(R^1)N-(C_1-C_6)$ -烷基、 $(R^1)_2N(O)C(R^1)N-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^2(O)_nS-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^1O(O)_2S-(C_1-C_6)$ -烷基、 $(R^1)_2N(O)_2S-(C_1-C_6)$ -烷基、 $(R^5O)_2(O)P-(C_1-C_6)$ -烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基- (C_1-C_6) -烷基、杂芳基- (C_1-C_6) -烷基、杂环基- (C_1-C_6) -烷基，其中最后提到的6个基团被s个选自硝基、卤素、氰基、氰硫基、 (C_1-C_6) -烷基、卤代- (C_1-C_6) -烷基、 R^1O 、 $(R^1)_2N$ 、 $R^2(O)_nS$ 、 $R^1O(O)_2S$ 、 $(R^1)_2N(O)_2S$ 和 $R^1O-(C_1-C_6)$ -烷基的基团取代，且其中杂环基带有n个氧代基团，

[0057] Z为氢、硝基、卤素、氰基、 (C_1-C_6) -烷基、卤代- (C_1-C_6) -烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -炔基、 (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_1-C_6) -烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基- (C_1-C_6) -烷基、 $R^1(O)C$ 、 $R^1(R^1ON=)C$ 、 $R^1O(O)C$ 、 $(R^1)_2N(O)C$ 、 R^1O 、 $(R^1)_2N$ 、 $R^1(O)C(R^1)N$ 、 $R^2(O)_2S(R^1)N$ 、 $R^2O(O)C(R^1)N$ 、 $(R^1)_2N(O)C(R^1)N$ 、 $R^2(O)_nS$ 、 $R^1O(O)_2S$ 、 $(R^1)_2N(O)_2S$ 、 $(R^5O)_2(O)P$ 、 $R^1(O)C-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^1O(O)C-(C_1-C_6)$ -烷基、 $(R^1)_2N(O)C-(C_1-C_6)$ -烷基、 $NC-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^1O-(C_1-C_6)$ -烷基、 $(R^1)_2N-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^1(O)C(R^1)N-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^2(O)_2S(R^1)N-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^2O(O)C(R^1)N-(C_1-C_6)$ -烷基、 $(R^1)_2N(O)C(R^1)N-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^2(O)_nS-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^1O(O)_2S-(C_1-C_6)$ -烷基、 $(R^1)_2N(O)_2S-(C_1-C_6)$ -烷基、 $(R^5O)_2(O)P-(C_1-C_6)$ -烷基、苯基、杂芳基、杂环基、苯基- (C_1-C_6) -烷基、杂芳基- (C_1-C_6) -烷基、杂环基- (C_1-C_6) -烷基，其中最后提到的6个基团被s个选自硝基、卤素、氰基、氰硫基、 (C_1-C_6) -烷基、卤代- (C_1-C_6) -烷基、 R^1O 、 $(R^1)_2N$ 、 $R^2(O)_nS$ 、 $R^1O(O)_2S$ 、 $(R^1)_2N(O)_2S$ 和 $R^1O-(C_1-C_6)$ -烷基的基团取代，且其中杂环基带有n个氧代基团，

[0058] W为氢、卤素、硝基、氰基、 (C_1-C_6) -烷基、卤代- (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_7) -环烷基、 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_1-C_6) -烷基- $(O)_nS$ 、 $R^1O(O)C$ 、 $(R^1)_2N$ 、 $R^1(O)C(R^1)N$ 或 $R^2(O)_2S(R^1)N$ ，

[0059] R为 (C_1-C_6) -烷基，其各自被s个选自卤素、氰基、 (C_3-C_6) -环烷基、 $R^1(O)C$ 、 $R^1(R^1ON=)C$ 、 $R^1O(O)C$ 、 $(R^1)_2N(O)C$ 、 $R^2(O)_2S(R^1)N(O)C$ 、 R^1O 、 $(R^1)_2N$ 、 $R^1(O)C(R^1)N$ 、 $R^2(O)_2S(R^1)N$ 、 $R^2O(O)C(R^1)N$ 、 $(R^1)_2N(O)C(R^1)N$ 、 $R^2(O)_nS$ 、 $R^1O(O)_2S$ 、 $(R^1)_2N(O)_2S$ 、 $R^1(O)C(R^1)N(O)_2S$ 、 $R^2O(O)C(R^1)N(O)_2S$ 和 $(R^1)_2N(O)C(R^1)N(O)_2S$ 的基团取代，或者

[0060] 为 (C_3-C_6) -环烷基，其各自被s个选自卤素、 (C_1-C_6) -烷基、卤代- (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、 $R^1O(O)C$ 和 $(R^1)_2N(O)C$ 的基团取代，

[0061] R'为氢、硝基、氰基、 (C_1-C_6) -烷基、卤代- (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_1-C_6) -烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基- (C_1-C_6) -烷基、 $R^1(O)C$ 、 $R^2O(O)C$ 、 $(R^1)_2N(O)C$ 、 $R^2(O)_2S$ 、 $R^1(O)C-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^1O(O)C-(C_1-C_6)$ -烷基、 $(R^1)_2N(O)C-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^1O-(C_1-C_6)$ -烷基、 $(R^1)_2N-(C_1-C_6)$ -烷基、 $R^2(O)_nS-(C_1-C_6)$ -烷基，

[0062] R^1 为氢、 (C_1-C_6) -烷基、卤代- (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷基- $O-(C_1-C_6)$ -烷基、环烷基- (C_1-C_6) -烷基- $O-(C_1-C_6)$ -烷基、苯基、苯基- (C_1-C_6) -烷基、杂芳基、杂芳基- (C_1-C_6) -烷基、杂环基、杂环基- (C_1-C_6) -烷基、苯基- $O-(C_1-C_6)$ -烷基、杂芳基- $O-(C_1-C_6)$ -烷基、杂环基- $O-(C_1-C_6)$ -烷基，其中最后提到的9个基团各自被s个选自硝基、卤素、 (C_1-C_6) -烷基、卤代- (C_1-C_6) -烷基、 $R^3O(O)C$ 、 $(R^3)_2N(O)C$ 、 R^3O 、 $(R^3)_2N$ 、 $R^4(O)_nS$ 和 $R^3O-(C_1-C_6)$ -烷基的基团取代，且其中杂环基带有n个

氧代基团,

[0063] R^2 为 (C_1-C_6) -烷基、卤代- (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -环烷基、卤代- (C_3-C_6) -环烷基、 (C_3-C_6) -环烷基- (C_1-C_6) -烷基、 (C_1-C_6) -烷基- O - (C_1-C_6) -烷基、环烷基- (C_1-C_6) -烷基- O - (C_1-C_6) -烷基、苯基、苯基- (C_1-C_6) -烷基、杂芳基、杂芳基- (C_1-C_6) -烷基、杂环基、杂环基- (C_1-C_6) -烷基、苯基- O - (C_1-C_6) -烷基、杂芳基- O - (C_1-C_6) -烷基、杂环基- O - (C_1-C_6) -烷基,其中最后提到的9个基团各自被 s 个选自硝基、卤素、 (C_1-C_6) -烷基、卤代- (C_1-C_6) -烷基、 $R^3O(O)C$ 、 $(R^3)_2N(O)C$ 、 R^3O 、 $(R^3)_2N$ 、 $R^4(O)_nS$ 和 R^3O - (C_1-C_6) -烷基的基团取代,且其中杂环基带有 n 个氧代基团,

[0064] R^3 为氢或 (C_1-C_6) -烷基,

[0065] R^4 为 (C_1-C_6) -烷基,

[0066] R^5 为氢或 (C_1-C_4) -烷基,

[0067] R^9 为卤素、 (C_1-C_4) -烷基、 (C_1-C_4) -卤代烷基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_1-C_4) -卤代烷氧基或 (C_1-C_4) -烷氧基- (C_1-C_4) -烷基,

[0068] n 为0、1或2,

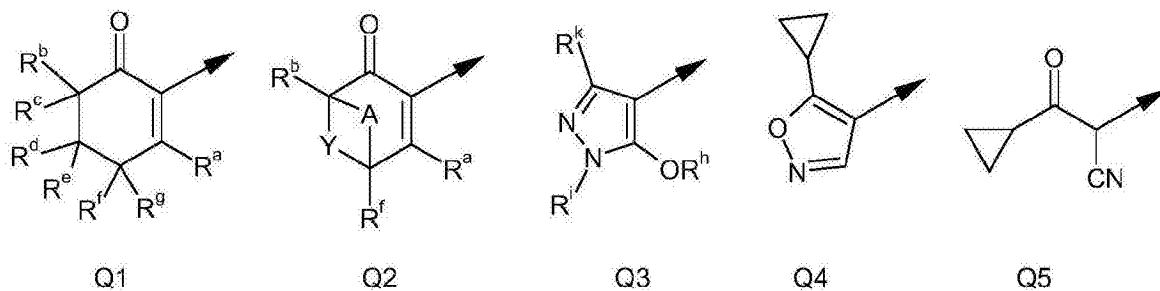
[0069] s 为0、1、2或3,

[0070] t 为0或1。

[0071] 特别优选式(I)的化合物,其中

[0072] Q 为基团Q1、Q2、Q3、Q4或Q5,

[0073]



[0074] R^a 为羟基,

[0075] R^b 、 R^c 、 R^f 和 R^g 各自独立地为氢或甲基,

[0076] R^d 、 R^e 为氢或与其连接的碳原子一起形成羰基,

[0077] R^h 为氢,

[0078] R^i 为甲基或乙基,

[0079] R^k 为氢、甲基或环丙基,

[0080] A 和 Y 各自独立地为 CH_2 或 CH_2CH_2 ,

[0081] X 为硝基、卤素、甲基、乙基、正丙基、异丙基、三氟甲基、二氟甲基、一氯二氟甲基、二氯一氟甲基、三氯甲基、五氟乙基、七氟异丙基、环丙基、甲氧基、乙氧基、甲基硫烷基、甲基亚磺酰基、甲基磺酰基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基、甲氧基乙氧基甲基、甲硫基甲基、甲基亚磺酰基甲基或甲基磺酰基甲基,

[0082] Z 为氢、硝基、氰基、卤素、甲基、乙基、正丙基、异丙基、三氟甲基、二氟甲基、一氯二氟甲基、二氯一氟甲基、三氯甲基、五氟乙基、七氟异丙基、环丙基、甲氧基、乙氧基、甲基硫烷基、甲基亚磺酰基或甲基磺酰基,

[0083] W为氢、氯或甲基，

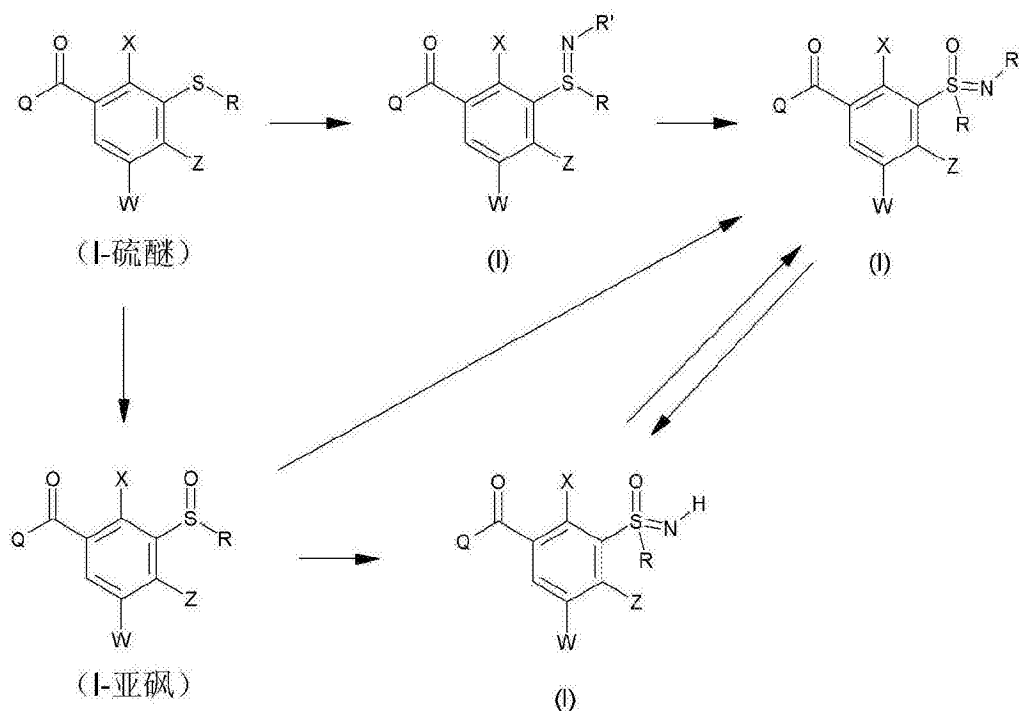
[0084] R为甲基、乙基或正丙基，

[0085] R'为氢或氰基

[0086] t为0或1。

[0087] 本发明的式(I)的化合物可由相应的式(I-硫醚)的硫醚(方案1)制备。为此,使用例如氨脒和氧化剂(二乙酸亚碘酰苯、次氯酸钠、N-溴代琥珀酰亚胺)将硫醚转化为相应的硫亚胺(sulfilimine),其可以被进一步氧化为亚砷亚胺。适用于氧化成亚砷亚胺的氧化剂为,例如,间氯过氧苯甲酸、高锰酸钠,或高碘酸钠与三氯化钨的混合物。NH-亚砷亚胺可例如使用叠氮化钠和硫酸由亚砷获得,并且可在氮原子上用如下试剂官能化:例如溴化氰、酰基氯、酸酐、氯甲酸酯、硝酸或其他化合物。N-磺化硫亚胺(sulfonated sulfilimines)氧化成相应的亚砷亚胺可例如用氢完成。或者,亚砷可转化成N-酰化的或N-磺化的亚砷亚胺。随后甲酰胺或磺酰胺可各自分解产生NH-亚砷亚胺。这些由硫醚产生硫亚胺和亚砷亚胺的合成方法,或由亚砷产生亚砷亚胺的合成方法,或衍生硫亚胺和亚砷亚胺以及NH-亚砷亚胺的方法尤其记载于例如Bolm, C.Org.Lett. 2004, 6, 1305; Bolm, C.Org.Lett. 2007, 9, 3809; Bolm, C.Synthesis 2010, 17, 2922; Bolm, C.Adv.Synth.Catal. 2010, 352, 309, WO 2007/095229 A1、WO 2008/141843 A1、WO 2008/097235 A1、US 2008/0207910 A1、US 2008/0194634 A1和US 2010/0056534 A1。

[0088] 方案1



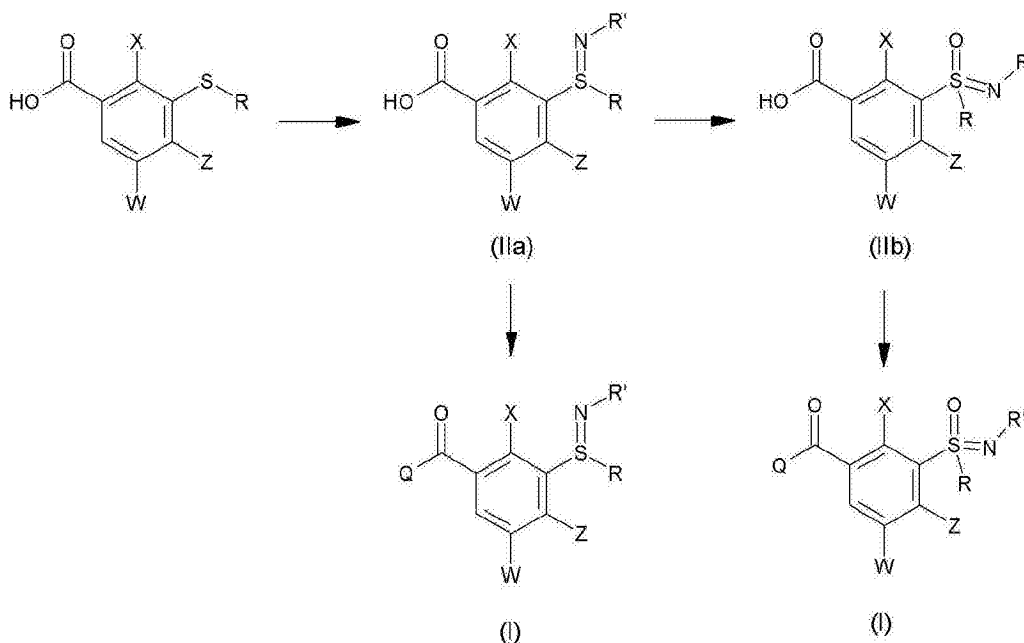
[0089]

[0090] 如果需要,这些合成步骤必须使用保护基团以达到足够的选择性。特别地,NH-亚砷亚胺的官能化原则上与酰胺氮原子的类似官能化相竞争。最佳的过程取决于所讨论的取代类型。

[0091] 式(I-硫醚)和式(I-亚砷)的化合物是已知的,并且记载于例如WO 2003/014071 A1、WO 2008/125214 A1、WO 2009/149806 A1、WO 2011012247 A1、WO 2011012247 A1、EP 0 609 798 A1和EP 0 625 508 A1。

[0092] 改变反应步骤的顺序可能是有利的。在某些条件下,亚砷亚胺、尤其是硫亚胺稳定性不足(Bolm, C. Adv. Synth. Catal. 2010, 352, 309),所以,如方案1所示,首先在硫醚阶段合成苯甲酰基衍生物并仅在合成步骤后期由硫醚产生硫亚胺或亚砷亚胺可能是有利的。然而,在足够稳定的情况下,根据取代类型,首先在苯甲酸阶段(或在更早阶段)由硫醚产生亚砷亚胺的硫亚胺,随后仅将苯甲酸转化成其苯甲酰基衍生物也是有利的(方案2)。由苯甲酸到其苯甲酰基衍生物的转化已知于多种不包含硫亚胺基团或亚砷亚胺基团的结构,且记载于例如WO 2003/014071 A1、WO 2008/125214 A1、WO 2009/149806 A1、WO 2011012247 A1、WO 2011012247 A1、EP 0 609 798 A1和EP 0 625 508 A1。根据取代类型,通过这条路线合成本发明式(I)的化合物可能是有利的。

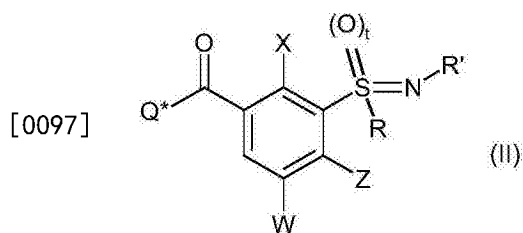
[0093] 方案2



[0094]

[0095] 在某些情况下,反应不使用游离的苯甲酸而使用其衍生物可能是有利的。有时,官能团仅在酸性介质或仅在碱性介质中操作的稳定性是足够的,即仅与游离的苯甲酸或仅与其盐一起操作。在很多情况下,酯如甲基酯或乙基酯是合适的。通常,叔丁基酯在空间上能有效屏蔽羧基以抵抗亲核试剂,且其在酸性介质中易于分解(T.W.Greene, P.G.M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 第2版, John Wiley&Sons, Inc. 1991, 第227页起)。另外合适的是比羧基稳定许多但同时还可易于重新转化为游离羧酸的基团。这些基团包括,例如,噁唑啉(T.W.Greene, P.G.M. Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, 第2版, John Wiley&Sons, Inc. 1991, 第265页起; Z.Hell等人, Tetrahedron Letters 43(2002), 3985-3987)。

[0096] 上述的式(IIa)和(IIb)的苯甲酸及其乙基酯、甲基酯和苯甲酰氯是新颖的并且可由式(II)代表。



[0098] 在式(II)中, Q*为羟基、乙氧基、甲氧基或氯。R、R'、X、W、Z和t的含义与式(I)中的相同。式(II)的化合物尤其适合制备本发明式(I)的化合物。式(II)的化合物也形成本发明主题的一部分。

[0099] 各反应混合物通常按照已知方法进行后处理, 例如, 通过重结晶, 水提取后处理, 通过色谱方法或通过这些方法的结合。

[0100] 可根据上述反应合成的式(I)的化合物或/和其盐的集合还可以以平行方式制备, 其可手动实现或以部分或全部自动化的方式实现。此处, 可例如使反应过程、产物或中间体的后处理或纯化自动化。大体上, 应理解为意指例如D. Tiebes在Combinatorial Chemistry-Synthesis, Analysis, Screening(Editor Günther Jung), Wiley 1999, 第1至34页中记载的过程。

[0101] 很多市售可得设备可用于平行反应过程和后处理, 如购自Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, USA的Calpso反应模块, 或购自Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 11 3AZ, England的反应站, 或购自Perkin Elmar, Waltham, Massachusetts 02451, USA的MultiPROBE自动工作站。例如购自ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA的色谱设备尤其可用于式(I)的化合物和其盐或在制备过程中产生的中间体的平行纯化。

[0102] 上述设备形成一种模块过程, 其中各个步骤自动进行, 但是在各步骤之间必须进行手动操作。这可通过使用部分整体或整体自动化系统而避免, 其中相关的自动化模块由例如机器人操控。这类自动化系统可例如Caliper, Hopkinton, MA 01748, USA。

[0103] 单独或多个合成步骤的进行可以通过使用聚合物负载试剂/清除树脂(scavenger resin)辅助。专业文献描述了一系列实验方案, 例如在ChemFiles, 第4卷, No. 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis(Sigma-Aldrich)中。

[0104] 除了本文所述的方法之外, 通式(I)的化合物及其盐的制备可以全部或部分地通过固相负载法进行。针对此目的, 将所述合成方法中的或适用于相关过程的合成方法中的各个中间体或全部中间体结合至合成树脂上。固相负载合成法在专业文献中有充分的描述, 例如Barry A. Bunin的“The Combinatorial Index”, Academic Press, 1998和Combinatorial Chemistry-Synthesis, Analysis, Screening(Editor Günther Jung), Wiley, 1999。使用固相负载合成法可以进行文献中已知的一系列方案, 这些方案也可以通过手动或自动的方法实施。反应可以使用例如IRORI技术, 在购自Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, USA的微反应器中进行。

[0105] 通过使用微波技术, 在固相上和液相中都可以实施单独的或多个合成步骤。专业文献中描述了一系列的实验方案, 例如在Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry(C.O. Kappe和A. Stadler编), Verlag Wiley, 2005中。

[0106] 根据本文所述的方法进行制备,可以获得物质集合形式的式(I)化合物及其盐,称为库(library)。本发明也涉及包括至少两种式(I)的化合物及其盐的库。

[0107] 本发明的式(I)的化合物(和/或其盐)在下文中也被统称为“本发明的化合物”,其对宽范围的经济上重要的单子叶和双子叶一年生有害植物具有优异的除草活性。所述活性物质还有效地作用于从根茎、根状茎和其他多年生器官中发芽的难以防治的多年生有害植物。

[0108] 因此,本发明也涉及防治不需要的植物或调节植物的生长的方法,优选用于作物植物中,其中将本发明的一种或更多种化合物施用在植物上(例如有害植物,例如单子叶或双子叶杂草或不需要的作物植物)、施用于种子(例如谷物、种子或无性繁殖体,例如块茎或带有萌芽的幼枝)或施用于植物生长区域(例如耕种区域)。在这一方面,本发明化合物可以例如在播种前施用(如果合适的话,也可以通过混入土壤而施用)、发芽前或发芽后施用。将提及可以通过本发明的化合物防治的单子叶和双子叶杂草植物群的各个有代表性的实例,而以下的列举并不限于特定种类。

[0109] 以下属的单子叶有害植物:山羊草属(*Aegilops*)、冰草属(*Agropyron*)、剪股颖属(*Agrostis*)、看麦娘属(*Alopecurus*)、假剪股颖属(*Apera*)、燕麦属(*Avena*)、臂形草属(*Brachiaria*)、雀麦属(*Bromus*)、蒺藜草属(*Cenchrus*)、鸭跖草属(*Commelina*)、狗牙根属(*Cynodon*)、莎草属(*Cyperus*)、龙爪茅属(*Dactyloctenium*)、马唐属(*Digitaria*)、稗属(*Echinochloa*)、荸荠属(*Eleocharis*)、蟋蟀草属(*Eleusine*)、画眉草属(*Eragrostis*)、野黍属(*Eriochloa*)、羊茅属(*Festuca*)、飘拂草属(*Fimbristylis*)、异蕊花属(*Heteranthera*)、白茅属(*Imperata*)、鸭嘴草属(*Ischaemum*)、千金子属(*Leptochloa*)、黑麦草属(*Lolium*)、雨久花属(*Monochoria*)、黍属(*Panicum*)、雀稗属(*Paspalum*)、藨草属(*Phalaris*)、梯牧草属(*Phleum*)、早熟禾属(*Poa*)、筒轴茅属(*Rottboellia*)、慈姑属(*Sagittaria*)、糜草属(*Scirpus*)、狗尾草属(*Setaria*)、高粱属(*Sorghum*)。

[0110] 以下属的双子叶杂草:苘麻属(*Abutilon*)、苋属(*Amaranthus*)、豚草属(*Ambrosia*)、单花葵属(*Anoda*)、春黄菊属(*Anthemis*)、蔷薇属(*Aphanes*)、蒿属(*Artemisia*)、滨藜属(*Atriplex*)、雏菊属(*Bellis*)、鬼针属(*Bidens*)、芥属(*Capsella*)、飞廉属(*Carduus*)、决明属(*Cassia*)、矢车菊属(*Centaurea*)、藜属(*Chenopodium*)、蓟属(*Cirsium*)、旋花属(*Convolvulus*)、曼陀罗属(*Datura*)、山蚂蝗属(*Desmodium*)、刺酸模属(*Emex*)、糖芥属(*Erysimum*)、大戟属(*Euphorbia*)、鼬瓣花属(*Galeopsis*)、牛膝菊属(*Galinsoga*)、拉拉藤属(*Galium*)、木槿属(*Hibiscus*)、番薯属(*Ipomoea*)、地肤属(*Kochia*)、野芝麻属(*Lamium*)、独行菜属(*Lepidium*)、母草属(*Lindernia*)、母菊属(*Matricaria*)、薄荷属(*Mentha*)、山靛属(*Mercurialis*)、粟米草属(*Mullugo*)、勿忘草属(*Myosotis*)、罂粟属(*Papaver*)、牵牛属(*Pharbitis*)、车前属(*Plantago*)、蓼属(*Polygonum*)、马齿苋属(*Portulaca*)、毛茛属(*Ranunculus*)、萝卜属(*Raphanus*)、蔊菜属(*Rorippa*)、节节菜属(*Rotala*)、酸模属(*Rumex*)、猪毛草属(*Salsola*)、千里光属(*Senecio*)、田菁属(*Sesbania*)、黄花稔属(*Sida*)、白芥属(*Sinapis*)、茄属(*Solanum*)、苦苣菜属(*Sonchus*)、尖瓣花属(*Sphenoclea*)、繁缕属(*Stellaria*)、蒲公英属(*Taraxacum*)、苜蓿属(*Thlaspi*)、车轴草属(*Trifolium*)、荨麻属(*Urtica*)、婆婆纳属(*Veronica*)、堇菜属(*Viola*)、苍耳属(*Xanthium*)。

[0111] 如果在发芽前将本发明的化合物施用至土壤,则完全阻止杂草的发芽,或者使得

杂草生长直至达到子叶期,但之后它们就停止生长,并最终在三至四周后完全死亡。

[0112] 当在发芽后将所述活性物质施用至植物的绿色部分,则在处理后生长停止,并且有害植物停留在施用时间点的生长阶段,或者在一段时间后完全死亡,从而在早期及时并以持续的方式消除对作物植物有害的杂草的竞争。

[0113] 虽然本发明的化合物对单子叶和双子叶杂草显示出优异的除草活性,但是经济上重要的作物的作物植物,例如以下属的双子叶作物:花生属(*Arachis*)、甜菜属(*Beta*)、芸苔属(*Brassica*)、黄瓜属(*Cucumis*)、南瓜属(*Cucurbita*)、向日葵属(*Helianthus*)、胡萝卜属(*Daucus*)、大豆属(*Glycine*)、棉属(*Gossypium*)、番薯属(*Ipomoea*)、莴苣属(*Lactuca*)、亚麻属(*Linum*)、番茄属(*Lycopersicon*)、烟草属(*Nicotiana*)、菜豆属(*Phaseolus*)、豌豆属(*Pisum*)、茄属(*Solanum*)、蚕豆属(*Vicia*),或以下属的单子叶作物:葱属(*Allium*)、凤梨属(*Ananas*)、天门冬属(*Asparagus*)、燕麦属(*Avena*)、大麦属(*Hordeum*)、稻属(*Oryza*)、黍属(*Panicum*)、甘蔗属(*Saccharum*)、黑麦属(*Secale*)、高粱属(*Sorghum*)、小黑麦属(*Triticale*)、小麦属(*Triticum*)、玉蜀黍属(*Zea*),特别是玉蜀黍属和小麦属的受损伤程度可以忽略不计,或者完全不会受到损伤,这取决于本发明各个化合物的结构和其施用率。这就是为什么本发明化合物高度适用于在作物植物中,例如农业有用植物或观赏植物中选择性地防治不想要的植物的生长。

[0114] 而且,本发明的化合物(取决于它们各自的结构和施用率)在作物植物中具有优异的生长调节性能。它们以调节的方式参与植物的新陈代谢,并且因此可以以靶向方式用于影响植物的组成,以及有助于采收,例如通过引发脱水和使植株矮小生长。而且,它们也适用于一般地防治和抑制不想要的营养生长而不破坏这个过程中的植物。抑制营养生长在许多单子叶和双子叶作物中起到了非常重要的作用,因为例如可以减少或完全防止倒伏。

[0115] 由于它们的除草活性和植物生长调节活性,所述活性物质也可用于在转基因植物中或通过常规诱变修饰的植物中防治有害植物。一般地,转基因植物特征在于具有特别有利的性质,例如对某些农药的抗性,主要是对于某些除草剂的抗性,对于植物病害或植物病害的致病生物的抗性,所述生物例如某些昆虫或微生物,例如真菌、细菌或病毒。其他特别性质涉及到例如采收物的产量、质量、储存性、组成,和特定成分。因此,已知具有提高的淀粉含量或改变的淀粉品质的转基因植物,或者在采收物中具有不同的脂肪酸组成的转基因植物。

[0116] 优选在经济上重要的有用植物和观赏性植物的转基因作物上使用本发明的化合物或其盐,所述作物例如谷物,如小麦、大麦、黑麦、燕麦、高粱和粟、稻、木薯和玉米,或者甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、番茄、豌豆以及其他蔬菜的作物。优选在对除草剂的植物毒性效果具有抗性或已通过重组方式产生抗性的有用植物作物中使用本发明的化合物作为除草剂。

[0117] 制备与已知的植物相比具有改进特性的新植物的常规方法为例如常规育种方法和突变体产生法。或者,具有改进特性的新植物可借助重组方法产生(参见例如,EP-A-0221044,EP-A-0131624)。例如,在多个案例中已描述以下情况:

[0118] -通过重组技术修饰作物植物,使植物中合成的淀粉改性(例如WO 92/11376、WO 92/14827、WO 91/19806),

[0119] -对某些草铵磷(*glufosinate*)类除草剂(参见例如EP-A-0242236、EP-A-0242246)

或草甘膦(gluphosate)类除草剂(WO 92/00377)或磺酰脲类除草剂(EP-A-0257993、US-A-5013659)具有抗性的转基因作物植物,

[0120] -能产生苏云金杆菌毒素(Bt毒素)从而对某些植物害虫具有抗性的转基因作物植物,例如棉花(EP-A-0142924、EP-A-0193259),

[0121] -具有改变的脂肪酸组成的转基因作物植物(WO 91/13972),

[0122] -具有新成分或次级代谢产物,例如能够带来增强的抗病能力的新的植物抗毒素的基因修饰作物植物(EPA 309862、EPA0464461),

[0123] -具有减少的光呼吸的基因修饰植物,其具有较高的产量和较高的胁迫耐受性(EPA 0305398),

[0124] -生产药用或诊断用的重要蛋白质的转基因作物植物(“分子农场”)

[0125] -以更高产量或更好品质为特征的转基因作物,

[0126] -以结合了例如上述新性能(“基因叠加”)为特征的转基因作物。

[0127] 许多能够制备具有改进性质的新转基因植物的分子生物技术原则上是已知的,参见例如I.Potrykus和G.Spangenberg(编写)的Gene Transfer to Plants, Springer Lab Manual(1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg。或者Christou, “Trends in Plant Science”1(1996)423-431。

[0128] 为了进行这类重组操作,可以将能够产生诱变或通过重组DNA序列产生序列改变的核酸分子引入质粒。借助于标准方法,可以例如进行碱基取代、可以移除部分序列或加入天然的或合成的序列。为了将DNA片段彼此连接,可以向片段中加入接头(adapter)或连接体(linker)。参见例如,Sambrook等人,1989, Molecular Cloning, A Laboratory Manual, 第二版, Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY; 或Winnacker “Gene und Klone”, VCH Weinheim第二版, 1996。

[0129] 例如,基因产物活性降低的植物细胞的产生可以通过下列方法实现:通过表达至少一种相应的反义RNA、用于实现共抑制效应的正义RNA,或者通过表达至少一种能够特异性切割上述基因产物的转录物并具有合适结构的核酶。为此目的,可以使用包括基因产物的完整编码序列——包括所有可能存在的侧翼序列——的DNA分子,也可以使用仅含有部分编码序列的DNA分子,但是所述部分编码序列必须足够长,以便在细胞中产生反义效果。也可以使用与所述基因产物的编码序列具有高度同源性但并不完全相同的DNA序列。

[0130] 当在植物中表达核酸分子时,所合成的蛋白可被定位至植物细胞的任何所需的区室中。然而,为了将其定位于某一区室,可以例如将编码区与确保在某一区室中定位的DNA序列相连接。这种序列是本领域中技术人员已知的(参见例如Braun等人,EMBO J.11(1992),3219-3227;Wolter等人,Proc.Natl.Acad.Sci.USA 85(1988),846-850;Sonnewald等人,Plant J.1(1991),95-106)。核酸分子也可以在植物细胞中的细胞器中表达。

[0131] 可以使用已知的技术使转基因植物细胞再生以获得完整的植物。原则上,所述转基因植物可为任何所需的植物品种,即既可为单子叶植物,也可为双子叶植物。

[0132] 因此,可以通过对同源(即天然)基因或基因序列的过表达、阻遏或抑制,或者通过异源(即外源)基因或基因序列的表达而获得性质改变的转基因植物。

[0133] 优选将本发明的化合物用于转基因作物中,所述转基因作物对生长调节剂例如麦草畏具有抗性,或者对抑制重要的植物酶(例如乙酰乳酸合成酶(ALS)、5-烯醇式丙酮酰莽

草酸-3-磷酸(EPSP)合成酶、谷氨酰胺合成酶(GS)或羟基苯丙酮酸双加氧酶(HPPD))的除草剂具有抗性,或者对选自磺酰脲、草甘膦、草铵磷或苯甲酰基异噁唑以及类似的活性物质的除草剂具有抗性。

[0134] 当将本发明的活性物质用于转基因作物时,除了可在其他作物中观察到的对于有害植物的效果之外,还经常发现施用于所述的转基因作物的特殊的效果,例如改变或特别是增宽的可以防治的杂草谱、改进的施用时可以使用的施用率、与转基因作物对其有抗性的除草剂的更良好的相容性,以及对转基因作物植物的生长和产量的影响。

[0135] 因此本发明还涉及本发明的化合物作为除草剂用于防治转基因作物中的有害植物的用途。

[0136] 本发明的化合物可以以常规剂型施用,所述常规剂型的形式有可湿性粉剂、乳油、可喷洒溶液剂、粉剂或颗粒剂,因此,本发明还涉及含有本发明的化合物的除草和植物生长调节组合物。

[0137] 根据所需的生物学和/或物理化学参数,可通过多种方式将本发明的化合物配制为制剂。可能的制剂的实例为:可湿性粉剂(WP)、水溶性粉剂(SP)、水溶性浓缩剂、乳油(EC)、乳剂(EW)例如水包油乳剂和油包水乳剂、可喷洒性溶液剂、悬浮浓缩剂(SC)、油基分散剂或水基分散剂、油混溶性溶液剂、胶囊悬浮剂(CS)、粉剂(DP)、拌种产品、用于撒播和土壤施用的颗粒剂、微颗粒形式的颗粒剂(GR)、喷洒颗粒剂、包衣颗粒剂和吸附颗粒剂、水分散性颗粒剂(WG)、水溶性颗粒剂(SG)、ULV制剂、微胶囊剂和蜡剂。

[0138] 这些制剂的各个类型原则上都是已知的,并在下列文献中有所描述,例如:Winnacker-Küchler,“Chemische Technologie”[Chemical Technology],Volume 7, C.Hanser Verlag Munich,第4版,1986;Wade van Valkenburg,“Pesticide Formulations”,Marcel Dekker,N.Y.,1973;K.Martens,“Spray Drying”Handbook,第3版,1979,G.Goodwin Ltd.London。

[0139] 必需的制剂助剂,例如惰性物质、表面活性剂、溶剂和其他添加剂同样也是已知的,并在下列文献中有所描述,例如:Watkins,“Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers”,第二版,Darland Books,Caldwell N.J.;H.v.Olphen,“Introduction to Clay Colloid Chemistry”;第二版,J.Wiley&Sons,N.Y.;C.Marsden,“Solvents Guide”;第二版,Interscience,N.Y.1963;McCutcheon’s“Detergents and Emulsifiers Annual”,MC Publ.Corp.,Ridgewood N.J.;Sisley and Wood,“Encyclopedia of Surface Active Agents”,Chem.Publ.Co.Inc.,N.Y.1964;**Schönfeldt**,“**Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte**”[Interface-active ethylene oxide adducts],Wiss.Verlagsgesell.,Stuttgart 1976;Winnacker-Küchler,“Chemische Technologie”,第7卷,C.Hanser Verlag Munich,第四版,1986。

[0140] 基于上述制剂,可以生产与其他农药活性物质——例如杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂和杀菌剂——以及与安全剂、肥料和/或生长调节剂的结合物,例如以成品制剂或桶混形式。合适的安全剂是例如吡唑解草酯(mefenpyr-diethyl)、环丙磺酰胺(cyprosulfamide)、双苯噁唑酸(isoxadifen-ethyl)、解草酯(cloquintocet-mexyl)和二氯丙烯胺(dichlormid)。

[0141] 可湿性粉剂为可均匀分散于水中的制剂,其除了含有活性物质和稀释剂或惰性物

质之外,还含有离子型表面活性剂和/或非离子型表面活性剂(湿润剂、分散剂),例如聚乙氧基化烷基酚、聚乙氧基化脂肪醇、聚乙氧基化脂肪胺、脂肪醇聚乙二醇醚硫酸盐、烷基磺酸盐、烷基苯磺酸盐、木素磺酸钠、2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸钠、二丁基萘磺酸钠或油酰基甲基牛磺酸钠。为了制备可湿性粉剂,例如在常规设备例如锤磨机、鼓风磨机和喷气磨机中精细研磨具有除草活性的化合物,并同时或随后与制剂助剂相混合。

[0142] 悬乳浓缩剂通过下述过程制备:将活性物质溶于有机溶剂(例如丁醇、环己酮、二甲基甲酰胺、二甲苯或更高沸点的芳香族化合物或烃类)或有机溶剂混合物中,并加入一种或多种离子型和/或非离子型表面活性剂(乳化剂)。可使用的乳化剂的实例为例如烷基芳基磺酸钙盐,例如十二烷基苯磺酸钙;或非离子型乳化剂,例如脂肪酸聚乙二醇酯、烷基芳基聚乙二醇醚、脂肪醇聚乙二醇醚、环氧丙烷-环氧乙烷缩合物、烷基聚醚、山梨聚糖酯,例如山梨聚糖脂肪酸酯或聚氧乙烯山梨聚糖酯例如聚氧乙烯山梨聚糖脂肪酸酯。

[0143] 粉剂可通过将活性物质与细分散的固体物质一起研磨而制备,所述固体物质例如滑石、天然粘土(例如高岭土、膨润土和叶蜡石)或硅藻土。

[0144] 悬浮浓缩剂可为水基或油基的。它们可以通过例如使用市售的球磨机湿法研磨而制备,如合适,可以任选地加入上文在例如其他剂型中所述的表面活性剂。

[0145] 乳剂例如水包油乳剂(EW),可以使用例如搅拌器、胶体磨机和/或静态混合器制备,使用水性有机溶剂以及如合适例如在上文其他剂型中所述的表面活性剂。

[0146] 颗粒剂可以通过将所述活性物质喷洒在能够吸附的颗粒状惰性物质上、或通过使用粘合剂将活性物质浓缩物施用到载体表面而制备,所述载体例如砂、高岭土或颗粒状惰性材料,所述粘合剂例如聚乙烯醇、聚丙烯酸钠或矿物油。合适的活性物质也可以以制备肥料颗粒的常规方式制备成颗粒——如果需要,可以制备为与肥料的混合物。

[0147] 水分散性颗粒剂通常可以通过常规方法制备,所述常规方法例如喷雾干燥法、流化床制粒法、盘式制粒法、使用高速混合器的混合法以及不使用固体惰性物质的挤出法。

[0148] 关于盘式、流化床、挤出法和喷雾法颗粒的制备,参见例如:“Spray-Drying Handbook”第三版,1979,G.Goodwin Ltd.,London;J.E.Browning,“Agglomeration”,Chemical and Engineering 1967,第147页及后文;“Perry's Chemical Engineer's Handbook”,第5版,McGraw-Hill,New York 1973,第8-57页中的方法。

[0149] 关于作物保护组合物制剂的更多细节,参见例如G.C.Klingman,“Weed Control as a Science”,John Wiley and Sons.,Inc.,New York,1961,81-96页;和J.D.Freyer,S.A.Evans,“Weed Control Handbook”,第5版,Blackwell Scientific Publications,Oxford,1968,第101-103页。

[0150] 所述农业化学制剂通常含有0.1至99重量%、特别地为0.1至95重量%的本发明的化合物。

[0151] 在可湿性粉剂中,活性物质的浓度例如为约10至90重量%,100重量%的余量由常规制剂成分组成。在悬乳浓缩剂中,活性物质的浓度可为约1至90重量%,优选为5至80重量%。粉剂形式的制剂中含有1至30重量%的活性化合物,优选为通常含有5至20重量%的活性物质;可喷洒性溶液剂中含有约0.05至80重量%、优选为2至50重量%的活性物质。对于水分散性颗粒剂而言,活性化合物的含量部分取决于活性化合物是以液体形式还是以固体形式存在,以及所使用的粒化助剂和填料等。在水分散性颗粒剂中,活性物质的含量例如

为1至95重量%，优选地为10至80重量%。

[0152] 此外，如果合适，所述活性物质制剂各自含有常用的助剂，例如粘合剂、润湿剂、分散剂、乳化剂、渗透剂、防腐剂、抗冻剂、溶剂、填料、载体、着色剂、消泡剂、蒸发抑制剂、pH值和粘度调节剂。

[0153] 基于这些制剂，还可以生产与其他农药活性物质（例如杀昆虫剂、杀螨剂、除草剂和杀真菌剂）以及与安全剂、肥料和/或生长调节剂的结合物，例如以成品制剂或桶混物的形式。

[0154] 可以与本发明的化合物以混合制剂或桶混形式结合的活性物质为，例如，已知的基于抑制以下物质的活性物质，所述物质是例如乙酰乳酸合成酶、乙酰辅酶A羧化酶、纤维素合成酶、烯醇式丙酮酰莽草酸-3-磷酸合成酶、谷氨酰胺合成酶、对羟基苯基丙酮酸双加氧酶、八氢番茄红素去饱和酶、光系统I、光系统II、原卟啉原氧化酶，例如记载于Weed Research 26(1986)441-445页或“The Pesticide Manual”，第14版，The British Crop Protection Council and the Royal Soc.of Chemistry,2003以及其中引用的文献中。已知的可与本发明化合物结合的除草剂或植物生长调节剂为，例如，以下的活性物质（所述活性化合物按照国际标准化组织（ISO）的通用名称或按照化学名称进行命名，如果合适，连同编号一起）并且往往包含所有的使用形式如酸、盐、酯和同分异构体（如立体异构体和光学异构体）。

[0155] 为了使用，如果合适，将以市售形式存在的制剂以常规方式进行稀释，例如可湿性粉剂、乳油、分散剂、水分散性颗粒剂可用水进行稀释。粉剂、土壤颗粒剂、用于播撒的颗粒剂和可喷洒性溶液剂形式的制剂在使用前通常不用其他惰性物质进一步稀释。

[0156] 式(I)的化合物所需的施用率随外界条件变化，例如温度、湿度和所使用的除草剂的性质等。其可在较宽的范围内变化，例如在0.001和1.0kg/ha之间和更多的活性物质，然而，优选在0.005和750g/ha之间。

[0157] 下列实施例用于说明本发明。

[0158] A. 化学实施例

[0159] 5-羟基-1,3-二甲基-4-[3-(N-氰基-S-甲基磺酰亚氨酰基)-2-甲氧基-4-(三氟甲基)苯甲酰基]吡啶(表中第4-160号实施例)的合成

[0160] 步骤1:3-(N-氰基-S-甲基磺酰亚氨酰基)-2-甲氧基-4-(三氟甲基)苯甲酸(表中第15-28号实施例)的合成

[0161] 将3.71g(33.1mmol)叔丁醇钾加入到溶于250ml甲醇的4.00g(15.0mmol)2-甲氧基-3-(甲基硫烷基)-4-(三氟甲基)苯甲酸溶液中。搅拌混合物10分钟，然后依次加入1.07g(25.5mmol)氰胺和4.81g(27.0mmol)N-溴代琥珀酰亚胺。之后在室温下搅拌内容物2h。然后利用旋转蒸发器除去混合物中的溶剂，且每次用120ml乙腈和水的混合物接收残余物。加入7.21g(45.1mmol)高锰酸钠一水合物，混合物在室温下搅拌一周。在这一周期间，间隔一天或两天，在每种情况下加入3.6g(22.5mmol)高锰酸钠一水合物。对于后处理，加入10重量%的硫酸氢钠水溶液。利用旋转蒸发器在最高30℃的温度下，溶剂被基本上除去。在冰水浴中冷却残余物，然后用1M盐酸酸化。混合物用冰冷的二氯甲烷萃取三次。利用旋转蒸发器除去有机相中的溶剂，且残余物通过色谱法纯化，得到1.30g纯度为80重量%的产物。

[0162] 步骤2:5-羟基-1,3-二甲基-4-[3-(N-氰基-S-甲基磺酰亚氨酰基)-2-甲氧基-4-

(三氟甲基)苯甲酰基]吡唑的合成

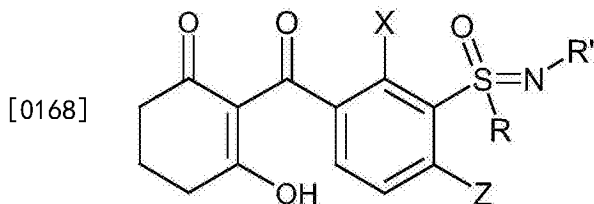
[0163] 首先将165mg(75重量%;0.384mmol)3-(N-氰基-S-甲基磺酰亚氨酰基)-2-甲氧基-4-(三氟甲基)苯甲酸和68.9mg(0.614mmol)5-羟基-1,3-二甲基吡唑加入到20ml二氯甲烷中,并加入128mg(0.666mmol)1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳二亚胺盐酸盐。室温下搅拌混合物16h,对于后处理,用1M盐酸洗涤。相分离后,对有机相进行干燥、过滤,并利用旋转蒸发仪除去有机相中的溶剂。残余物通过色谱法纯化,然后将所得中间物溶解在15ml乙腈中。之后加入104mg(1.02mmol)三乙胺、8滴三甲基氰化物(trimethylcyanide)和一抹刀尖端(spatula tip)的氰化钾。室温下搅拌混合物16h,对于后处理,除去混合物中的溶剂。残余物用二氯甲烷接收,并用3ml 1M盐酸进行洗涤。相分离后,除去有机相中的溶剂,残余物通过色谱法纯化,得到31.3mg纯度为85重量%的5-羟基-1,3-二甲基-4-[3-(N-氰基-S-甲基磺酰亚氨酰基)-2-甲氧基-4-(三氟甲基)苯甲酰基]吡唑。

[0164] 下表中所列的实例用与上述方法类似的方法制备或用与上述方法类似的方法得到。这些化合物是特别优选的。

[0165] 使用的缩写是:

[0166] Et=乙基 Me=甲基 n-Pr=正丙基 i-Pr=异丙基 c-Pr=环丙基 Ph=苯基

[0167] 表1:本发明式(I)的化合物,其中Q为Q1,R^a为羟基,基团R^b、R^c、R^d、R^e、R^f、R^g和W各自为氢,t=1,且其他基团具有表中指出的含义。



[0169]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|----|--------------------|----|----|---------------------------|
| 1-1 | Me | Me | Me | H | |
| 1-2 | Me | F | Me | H | |
| 1-3 | Me | Cl | Me | H | |
| 1-4 | Me | Br | Me | H | |
| 1-5 | Me | I | Me | H | |
| 1-6 | Me | CF ₃ | Me | H | |
| 1-7 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 1-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 1-9 | Me | OMe | Me | H | |
| 1-10 | Me | NO ₂ | Me | H | |
| 1-11 | Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 1-12 | Cl | Me | Me | H | |
| 1-13 | Cl | F | Me | H | |
| 1-14 | Cl | Cl | Me | H | |
| 1-15 | Cl | Br | Me | H | |

| | | | | | |
|------|-----|--------------------|----|---|--|
| 1-16 | Cl | I | Me | H | |
| 1-17 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 1-18 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 1-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 1-20 | Cl | OMe | Me | H | |
| 1-21 | Cl | NO ₂ | Me | H | |
| 1-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | H | |
| 1-23 | OMe | Me | Me | H | |
| 1-24 | OMe | F | Me | H | |
| 1-25 | OMe | Cl | Me | H | |

[0170]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 1-26 | OMe | Br | Me | H | |
| 1-27 | OMe | I | Me | H | |
| 1-28 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 1-29 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |
| 1-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 1-31 | OMe | OMe | Me | H | |
| 1-32 | OMe | NO ₂ | Me | H | |
| 1-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | H | |
| 1-34 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 1-35 | SO ₂ Me | F | Me | H | |
| 1-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 1-37 | SO ₂ Me | Br | Me | H | |
| 1-38 | SO ₂ Me | I | Me | H | |
| 1-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 1-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 1-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 1-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | H | |
| 1-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | H | |
| 1-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 1-45 | Me | Me | Et | H | |
| 1-46 | Me | F | Et | H | |
| 1-47 | Me | Cl | Et | H | |
| 1-48 | Me | Br | Et | H | |
| 1-49 | Me | I | Et | H | |
| 1-50 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 1-51 | Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 1-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | H | |

| | | | | | |
|------|----|--------------------|----|---|--|
| 1-53 | Me | OMe | Et | H | |
| 1-54 | Me | NO ₂ | Et | H | |
| 1-55 | Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 1-56 | Cl | Me | Et | H | |
| 1-57 | Cl | F | Et | H | |
| 1-58 | Cl | Cl | Et | H | |
| 1-59 | Cl | Br | Et | H | |
| 1-60 | Cl | I | Et | H | |
| 1-61 | Cl | CF ₃ | Et | H | |
| 1-62 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |

[0171]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 1-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 1-64 | Cl | OMe | Et | H | |
| 1-65 | Cl | NO ₂ | Et | H | |
| 1-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | H | |
| 1-67 | OMe | Me | Et | H | |
| 1-68 | OMe | F | Et | H | |
| 1-69 | OMe | Cl | Et | H | |
| 1-70 | OMe | Br | Et | H | |
| 1-71 | OMe | I | Et | H | |
| 1-72 | OMe | CF ₃ | Et | H | |
| 1-73 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 1-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 1-75 | OMe | OMe | Et | H | |
| 1-76 | OMe | NO ₂ | Et | H | |
| 1-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | H | |
| 1-78 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 1-79 | SO ₂ Me | F | Et | H | |
| 1-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |
| 1-81 | SO ₂ Me | Br | Et | H | |
| 1-82 | SO ₂ Me | I | Et | H | |
| 1-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |
| 1-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 1-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 1-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | H | |
| 1-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | H | |
| 1-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 1-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

| | | | | | |
|------|----|--------------------|-------------------------------------|---|--|
| 1-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

[0172]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 1-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 1-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 1-133 | Me | Me | Me | CN | |
| 1-134 | Me | F | Me | CN | |
| 1-135 | Me | Cl | Me | CN | |
| 1-136 | Me | Br | Me | CN | |

[0173]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|-----|--------------------|----|----|---------------------------|
| 1-137 | Me | I | Me | CN | |
| 1-138 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 1-139 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 1-140 | Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 1-141 | Me | OMe | Me | CN | |
| 1-142 | Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 1-143 | Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 1-144 | Cl | Me | Me | CN | |
| 1-145 | Cl | F | Me | CN | |
| 1-146 | Cl | Cl | Me | CN | |
| 1-147 | Cl | Br | Me | CN | |
| 1-148 | Cl | I | Me | CN | |
| 1-149 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |
| 1-150 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 1-151 | Cl | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 1-152 | Cl | OMe | Me | CN | |
| 1-153 | Cl | NO ₂ | Me | CN | |
| 1-154 | Cl | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 1-155 | OMe | Me | Me | CN | |
| 1-156 | OMe | F | Me | CN | |
| 1-157 | OMe | Cl | Me | CN | |
| 1-158 | OMe | Br | Me | CN | |
| 1-159 | OMe | I | Me | CN | |
| 1-160 | OMe | CF ₃ | Me | CN | |
| 1-161 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 1-162 | OMe | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 1-163 | OMe | OMe | Me | CN | |

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|--|
| 1-164 | OMe | NO ₂ | Me | CN | |
| 1-165 | OMe | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 1-166 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 1-167 | SO ₂ Me | F | Me | CN | |
| 1-168 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |
| 1-169 | SO ₂ Me | Br | Me | CN | |
| 1-170 | SO ₂ Me | I | Me | CN | |
| 1-171 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 1-172 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 1-173 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |

[0174]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 1-174 | SO ₂ Me | OMe | Me | CN | |
| 1-175 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 1-176 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 1-177 | Me | Me | Et | CN | |
| 1-178 | Me | F | Et | CN | |
| 1-179 | Me | Cl | Et | CN | |
| 1-180 | Me | Br | Et | CN | |
| 1-181 | Me | I | Et | CN | |
| 1-182 | Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 1-183 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 1-184 | Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 1-185 | Me | OMe | Et | CN | |
| 1-186 | Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 1-187 | Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 1-188 | Cl | Me | Et | CN | |
| 1-189 | Cl | F | Et | CN | |
| 1-190 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 1-191 | Cl | Br | Et | CN | |
| 1-192 | Cl | I | Et | CN | |
| 1-193 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 1-194 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |
| 1-195 | Cl | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 1-196 | Cl | OMe | Et | CN | |
| 1-197 | Cl | NO ₂ | Et | CN | |
| 1-198 | Cl | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 1-199 | OMe | Me | Et | CN | |
| 1-200 | OMe | F | Et | CN | |

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|--|
| 1-201 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 1-202 | OMe | Br | Et | CN | |
| 1-203 | OMe | I | Et | CN | |
| 1-204 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 1-205 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |
| 1-206 | OMe | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 1-207 | OMe | OMe | Et | CN | |
| 1-208 | OMe | NO ₂ | Et | CN | |
| 1-209 | OMe | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 1-210 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |

[0175]

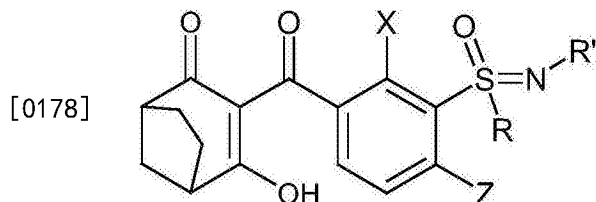
| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 1-211 | SO ₂ Me | F | Et | CN | |
| 1-212 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 1-213 | SO ₂ Me | Br | Et | CN | |
| 1-214 | SO ₂ Me | I | Et | CN | |
| 1-215 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 1-216 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 1-217 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 1-218 | SO ₂ Me | OMe | Et | CN | |
| 1-219 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 1-220 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 1-221 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-222 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-223 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-224 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-225 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-226 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-227 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-228 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-229 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-230 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-231 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-232 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-233 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-234 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-235 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-236 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-237 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

| | | | | | |
|-------|-----|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 1-238 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-239 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-240 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-241 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-242 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-243 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-244 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-245 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-246 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-247 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0176]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 1-248 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-249 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-250 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-251 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-252 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-253 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-254 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-255 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-256 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-257 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-258 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-259 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-260 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-261 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-262 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-263 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 1-264 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0177] 表2:本发明式(I)的化合物,其中Q为Q2,R^a为羟基,R^b、R^f和W各自为氢,A为CH₂CH₂,Y为CH₂,t=1,且其他基团具有表中指出的含义。



[0179]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-----|----|----|----|----|---------------------------|
| 2-1 | Me | Me | Me | H | |

| | | | | | |
|------|----|--------------------|----|---|--|
| 2-2 | Me | F | Me | H | |
| 2-3 | Me | Cl | Me | H | |
| 2-4 | Me | Br | Me | H | |
| 2-5 | Me | I | Me | H | |
| 2-6 | Me | CF ₃ | Me | H | |
| 2-7 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 2-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 2-9 | Me | OMe | Me | H | |
| 2-10 | Me | NO ₂ | Me | H | |

[0180]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 2-11 | Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 2-12 | Cl | Me | Me | H | |
| 2-13 | Cl | F | Me | H | |
| 2-14 | Cl | Cl | Me | H | |
| 2-15 | Cl | Br | Me | H | |
| 2-16 | Cl | I | Me | H | |
| 2-17 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 2-18 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 2-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 2-20 | Cl | OMe | Me | H | |
| 2-21 | Cl | NO ₂ | Me | H | |
| 2-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | H | |
| 2-23 | OMe | Me | Me | H | |
| 2-24 | OMe | F | Me | H | |
| 2-25 | OMe | Cl | Me | H | |
| 2-26 | OMe | Br | Me | H | |
| 2-27 | OMe | I | Me | H | |
| 2-28 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 2-29 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |
| 2-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 2-31 | OMe | OMe | Me | H | |
| 2-32 | OMe | NO ₂ | Me | H | |
| 2-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | H | |
| 2-34 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 2-35 | SO ₂ Me | F | Me | H | |
| 2-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 2-37 | SO ₂ Me | Br | Me | H | |
| 2-38 | SO ₂ Me | I | Me | H | |

| | | | | | |
|------|--------------------|--------------------|----|---|--|
| 2-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 2-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 2-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 2-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | H | |
| 2-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | H | |
| 2-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 2-45 | Me | Me | Et | H | |
| 2-46 | Me | F | Et | H | |
| 2-47 | Me | Cl | Et | H | |

[0181]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|-----|--------------------|----|----|---------------------------|
| 2-48 | Me | Br | Et | H | |
| 2-49 | Me | I | Et | H | |
| 2-50 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 2-51 | Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 2-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 2-53 | Me | OMe | Et | H | |
| 2-54 | Me | NO ₂ | Et | H | |
| 2-55 | Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 2-56 | Cl | Me | Et | H | |
| 2-57 | Cl | F | Et | H | |
| 2-58 | Cl | Cl | Et | H | |
| 2-59 | Cl | Br | Et | H | |
| 2-60 | Cl | I | Et | H | |
| 2-61 | Cl | CF ₃ | Et | H | |
| 2-62 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |
| 2-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 2-64 | Cl | OMe | Et | H | |
| 2-65 | Cl | NO ₂ | Et | H | |
| 2-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | H | |
| 2-67 | OMe | Me | Et | H | |
| 2-68 | OMe | F | Et | H | |
| 2-69 | OMe | Cl | Et | H | |
| 2-70 | OMe | Br | Et | H | |
| 2-71 | OMe | I | Et | H | |
| 2-72 | OMe | CF ₃ | Et | H | |
| 2-73 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 2-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 2-75 | OMe | OMe | Et | H | |

| | | | | | |
|------|--------------------|--------------------|----|---|--|
| 2-76 | OMe | NO ₂ | Et | H | |
| 2-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | H | |
| 2-78 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 2-79 | SO ₂ Me | F | Et | H | |
| 2-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |
| 2-81 | SO ₂ Me | Br | Et | H | |
| 2-82 | SO ₂ Me | I | Et | H | |
| 2-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |
| 2-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |

[0182]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 2-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 2-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | H | |
| 2-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | H | |
| 2-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 2-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

| | | | | | |
|-------|-----|--------------------|-------------------------------------|---|--|
| 2-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

[0183]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 2-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 2-133 | Me | Me | Me | CN | |
| 2-134 | Me | F | Me | CN | |
| 2-135 | Me | Cl | Me | CN | |
| 2-136 | Me | Br | Me | CN | |
| 2-137 | Me | I | Me | CN | |
| 2-138 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 2-139 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 2-140 | Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 2-141 | Me | OMe | Me | CN | |
| 2-142 | Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 2-143 | Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 2-144 | Cl | Me | Me | CN | |
| 2-145 | Cl | F | Me | CN | |
| 2-146 | Cl | Cl | Me | CN | |
| 2-147 | Cl | Br | Me | CN | |
| 2-148 | Cl | I | Me | CN | |
| 2-149 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |

| | | | | | |
|-------|-----|--------------------|----|----|--|
| 2-150 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 2-151 | Cl | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 2-152 | Cl | OMe | Me | CN | |
| 2-153 | Cl | NO ₂ | Me | CN | |
| 2-154 | Cl | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 2-155 | OMe | Me | Me | CN | |
| 2-156 | OMe | F | Me | CN | |
| 2-157 | OMe | Cl | Me | CN | |
| 2-158 | OMe | Br | Me | CN | |

[0184]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|--|
| 2-159 | OMe | I | Me | CN | |
| 2-160 | OMe | CF ₃ | Me | CN | (400 MHz, CDCl ₃ δ, ppm) 7.81 (m,1H), 7.65 (d,1H), 3.91 + 3.88 (s + s,3H), 3.65 + 3.62 (s + s,3H), 3.21 (m,1H), 2.91 (m,1H) |
| 2-161 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 2-162 | OMe | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 2-163 | OMe | OMe | Me | CN | |
| 2-164 | OMe | NO ₂ | Me | CN | |
| 2-165 | OMe | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 2-166 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 2-167 | SO ₂ Me | F | Me | CN | |
| 2-168 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |
| 2-169 | SO ₂ Me | Br | Me | CN | |
| 2-170 | SO ₂ Me | I | Me | CN | |
| 2-171 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 2-172 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 2-173 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 2-174 | SO ₂ Me | OMe | Me | CN | |
| 2-175 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 2-176 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 2-177 | Me | Me | Et | CN | |
| 2-178 | Me | F | Et | CN | |
| 2-179 | Me | Cl | Et | CN | |
| 2-180 | Me | Br | Et | CN | |
| 2-181 | Me | I | Et | CN | |
| 2-182 | Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 2-183 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 2-184 | Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 2-185 | Me | OMe | Et | CN | |
| 2-186 | Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 2-187 | Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 2-188 | Cl | Me | Et | CN | |
| 2-189 | Cl | F | Et | CN | |
| 2-190 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 2-191 | Cl | Br | Et | CN | |
| 2-192 | Cl | I | Et | CN | |

[0185]

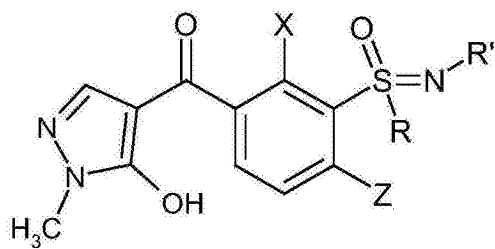
| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 2-193 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 2-194 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |
| 2-195 | Cl | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 2-196 | Cl | OMe | Et | CN | |
| 2-197 | Cl | NO ₂ | Et | CN | |
| 2-198 | Cl | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 2-199 | OMe | Me | Et | CN | |
| 2-200 | OMe | F | Et | CN | |
| 2-201 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 2-202 | OMe | Br | Et | CN | |
| 2-203 | OMe | I | Et | CN | |
| 2-204 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 2-205 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |
| 2-206 | OMe | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 2-207 | OMe | OMe | Et | CN | |
| 2-208 | OMe | NO ₂ | Et | CN | |
| 2-209 | OMe | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 2-210 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |
| 2-211 | SO ₂ Me | F | Et | CN | |
| 2-212 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 2-213 | SO ₂ Me | Br | Et | CN | |
| 2-214 | SO ₂ Me | I | Et | CN | |
| 2-215 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 2-216 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 2-217 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 2-218 | SO ₂ Me | OMe | Et | CN | |
| 2-219 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 2-220 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 2-221 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-222 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-223 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-224 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-225 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-226 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-227 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-228 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-229 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0186]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 2-230 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-231 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-232 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-233 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-234 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-235 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-236 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-237 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-238 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-239 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-240 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-241 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-242 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-243 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-244 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-245 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-246 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-247 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-248 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-249 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-250 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-251 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-252 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-253 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-254 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-255 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-256 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-257 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-258 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-259 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-260 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-261 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-262 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-263 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 2-264 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0187] 表3:本发明式(I)的化合物,其中Q为Q3,Rⁱ为甲基,R^h、R^k和W各自为氢,t=1,且其他基团具有表中指出的含义。

[0188]



[0189]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|-----|--------------------|----|----|---------------------------|
| 3-1 | Me | Me | Me | H | |
| 3-2 | Me | F | Me | H | |
| 3-3 | Me | Cl | Me | H | |
| 3-4 | Me | Br | Me | H | |
| 3-5 | Me | I | Me | H | |
| 3-6 | Me | CF ₃ | Me | H | |
| 3-7 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 3-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 3-9 | Me | OMe | Me | H | |
| 3-10 | Me | NO ₂ | Me | H | |
| 3-11 | Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 3-12 | Cl | Me | Me | H | |
| 3-13 | Cl | F | Me | H | |
| 3-14 | Cl | Cl | Me | H | |
| 3-15 | Cl | Br | Me | H | |
| 3-16 | Cl | I | Me | H | |
| 3-17 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 3-18 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 3-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 3-20 | Cl | OMe | Me | H | |
| 3-21 | Cl | NO ₂ | Me | H | |
| 3-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | H | |
| 3-23 | OMe | Me | Me | H | |
| 3-24 | OMe | F | Me | H | |
| 3-25 | OMe | Cl | Me | H | |
| 3-26 | OMe | Br | Me | H | |
| 3-27 | OMe | I | Me | H | |
| 3-28 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 3-29 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |
| 3-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | H | |

[0190]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|------|--------------------|--------------------|----|---|--|
| 3-31 | OMe | OMe | Me | H | |
| 3-32 | OMe | NO ₂ | Me | H | |
| 3-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | H | |
| 3-34 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 3-35 | SO ₂ Me | F | Me | H | |
| 3-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 3-37 | SO ₂ Me | Br | Me | H | |
| 3-38 | SO ₂ Me | I | Me | H | |
| 3-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 3-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 3-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 3-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | H | |
| 3-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | H | |
| 3-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 3-45 | Me | Me | Et | H | |
| 3-46 | Me | F | Et | H | |
| 3-47 | Me | Cl | Et | H | |
| 3-48 | Me | Br | Et | H | |
| 3-49 | Me | I | Et | H | |
| 3-50 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 3-51 | Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 3-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 3-53 | Me | OMe | Et | H | |
| 3-54 | Me | NO ₂ | Et | H | |
| 3-55 | Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 3-56 | Cl | Me | Et | H | |
| 3-57 | Cl | F | Et | H | |
| 3-58 | Cl | Cl | Et | H | |
| 3-59 | Cl | Br | Et | H | |
| 3-60 | Cl | I | Et | H | |
| 3-61 | Cl | CF ₃ | Et | H | |
| 3-62 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |
| 3-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 3-64 | Cl | OMe | Et | H | |
| 3-65 | Cl | NO ₂ | Et | H | |
| 3-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | H | |
| 3-67 | OMe | Me | Et | H | |

[0191]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---|--|
| 3-68 | OMe | F | Et | H | |
| 3-69 | OMe | Cl | Et | H | |
| 3-70 | OMe | Br | Et | H | |
| 3-71 | OMe | I | Et | H | |
| 3-72 | OMe | CF ₃ | Et | H | |
| 3-73 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 3-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 3-75 | OMe | OMe | Et | H | |
| 3-76 | OMe | NO ₂ | Et | H | |
| 3-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | H | |
| 3-78 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 3-79 | SO ₂ Me | F | Et | H | |
| 3-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |
| 3-81 | SO ₂ Me | Br | Et | H | |
| 3-82 | SO ₂ Me | I | Et | H | |
| 3-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |
| 3-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 3-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 3-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | H | |
| 3-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | H | |
| 3-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 3-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

[0192]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 3-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3-133 | Me | Me | Me | CN | |
| 3-134 | Me | F | Me | CN | |
| 3-135 | Me | Cl | Me | CN | |
| 3-136 | Me | Br | Me | CN | |
| 3-137 | Me | I | Me | CN | |
| 3-138 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 3-139 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 3-140 | Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 3-141 | Me | OMe | Me | CN | |

[0193]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|--|
| 3-142 | Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 3-143 | Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 3-144 | Cl | Me | Me | CN | |
| 3-145 | Cl | F | Me | CN | |
| 3-146 | Cl | Cl | Me | CN | |
| 3-147 | Cl | Br | Me | CN | |
| 3-148 | Cl | I | Me | CN | |
| 3-149 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |
| 3-150 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 3-151 | Cl | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 3-152 | Cl | OMe | Me | CN | |
| 3-153 | Cl | NO ₂ | Me | CN | |
| 3-154 | Cl | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 3-155 | OMe | Me | Me | CN | |
| 3-156 | OMe | F | Me | CN | |
| 3-157 | OMe | Cl | Me | CN | |
| 3-158 | OMe | Br | Me | CN | |
| 3-159 | OMe | I | Me | CN | |
| 3-160 | OMe | CF ₃ | Me | CN | (400 MHz, CDCl ₃ , δ, ppm) 7.94 (d,1H), 7.86 (d,1H), 7.52 (s,1H), 3.99 (s,3H), 3.75 (s,3H), 3.69 (s,3H) |
| 3-161 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 3-162 | OMe | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 3-163 | OMe | OMe | Me | CN | |
| 3-164 | OMe | NO ₂ | Me | CN | |
| 3-165 | OMe | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 3-166 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 3-167 | SO ₂ Me | F | Me | CN | |
| 3-168 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |
| 3-169 | SO ₂ Me | Br | Me | CN | |
| 3-170 | SO ₂ Me | I | Me | CN | |
| 3-171 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 3-172 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 3-173 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 3-174 | SO ₂ Me | OMe | Me | CN | |
| 3-175 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 3-176 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | CN | |

[0194]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 3-177 | Me | Me | Et | CN | |
| 3-178 | Me | F | Et | CN | |
| 3-179 | Me | Cl | Et | CN | |
| 3-180 | Me | Br | Et | CN | |
| 3-181 | Me | I | Et | CN | |
| 3-182 | Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 3-183 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 3-184 | Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 3-185 | Me | OMe | Et | CN | |
| 3-186 | Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 3-187 | Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 3-188 | Cl | Me | Et | CN | |
| 3-189 | Cl | F | Et | CN | |
| 3-190 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 3-191 | Cl | Br | Et | CN | |
| 3-192 | Cl | I | Et | CN | |
| 3-193 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 3-194 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |
| 3-195 | Cl | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 3-196 | Cl | OMe | Et | CN | |
| 3-197 | Cl | NO ₂ | Et | CN | |
| 3-198 | Cl | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 3-199 | OMe | Me | Et | CN | |
| 3-200 | OMe | F | Et | CN | |
| 3-201 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 3-202 | OMe | Br | Et | CN | |
| 3-203 | OMe | I | Et | CN | |
| 3-204 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 3-205 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |
| 3-206 | OMe | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 3-207 | OMe | OMe | Et | CN | |
| 3-208 | OMe | NO ₂ | Et | CN | |
| 3-209 | OMe | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 3-210 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |
| 3-211 | SO ₂ Me | F | Et | CN | |
| 3-212 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 3-213 | SO ₂ Me | Br | Et | CN | |

[0195]

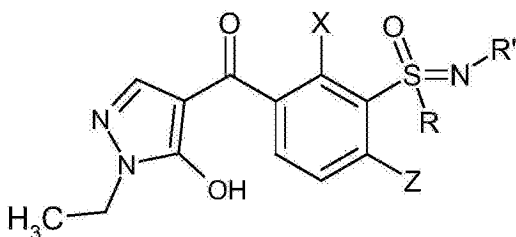
| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 3-214 | SO ₂ Me | I | Et | CN | |
| 3-215 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 3-216 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 3-217 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 3-218 | SO ₂ Me | OMe | Et | CN | |
| 3-219 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 3-220 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 3-221 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-222 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-223 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-224 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-225 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-226 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-227 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-228 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-229 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-230 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-231 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-232 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-233 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-234 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-235 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-236 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-237 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-238 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-239 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-240 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-241 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-242 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-243 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-244 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-245 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-246 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-247 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-248 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-249 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-250 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0196]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 3-251 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-252 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-253 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-254 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-255 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-256 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-257 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-258 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-259 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-260 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-261 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-262 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-263 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3-264 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0197] 表3a:本发明式(I)的化合物,其中Q为Q3,R¹为乙基,R^h、R^k和W各自为氢,t=1,且其他基团具有表中指出的含义。

[0198]



[0199]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|----|--------------------|----|----|---------------------------|
| 3a-1 | Me | Me | Me | H | |
| 3a-2 | Me | F | Me | H | |
| 3a-3 | Me | Cl | Me | H | |
| 3a-4 | Me | Br | Me | H | |
| 3a-5 | Me | I | Me | H | |
| 3a-6 | Me | CF ₃ | Me | H | |
| 3a-7 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 3a-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 3a-9 | Me | OMe | Me | H | |
| 3a-10 | Me | NO ₂ | Me | H | |
| 3a-11 | Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 3a-12 | Cl | Me | Me | H | |
| 3a-13 | Cl | F | Me | H | |
| 3a-14 | Cl | Cl | Me | H | |

[0200]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 3a-15 | Cl | Br | Me | H | |
| 3a-16 | Cl | I | Me | H | |
| 3a-17 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 3a-18 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 3a-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 3a-20 | Cl | OMe | Me | H | |
| 3a-21 | Cl | NO ₂ | Me | H | |
| 3a-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | H | |
| 3a-23 | OMe | Me | Me | H | |
| 3a-24 | OMe | F | Me | H | |
| 3a-25 | OMe | Cl | Me | H | |
| 3a-26 | OMe | Br | Me | H | |
| 3a-27 | OMe | I | Me | H | |
| 3a-28 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 3a-29 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |
| 3a-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 3a-31 | OMe | OMe | Me | H | |
| 3a-32 | OMe | NO ₂ | Me | H | |
| 3a-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | H | |
| 3a-34 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 3a-35 | SO ₂ Me | F | Me | H | |
| 3a-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 3a-37 | SO ₂ Me | Br | Me | H | |
| 3a-38 | SO ₂ Me | I | Me | H | |
| 3a-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 3a-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 3a-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 3a-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | H | |
| 3a-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | H | |
| 3a-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 3a-45 | Me | Me | Et | H | |
| 3a-46 | Me | F | Et | H | |
| 3a-47 | Me | Cl | Et | H | |
| 3a-48 | Me | Br | Et | H | |
| 3a-49 | Me | I | Et | H | |
| 3a-50 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 3a-51 | Me | CHF ₂ | Et | H | |

[0201]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 3a-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 3a-53 | Me | OMe | Et | H | |
| 3a-54 | Me | NO ₂ | Et | H | |
| 3a-55 | Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 3a-56 | Cl | Me | Et | H | |
| 3a-57 | Cl | F | Et | H | |
| 3a-58 | Cl | Cl | Et | H | |
| 3a-59 | Cl | Br | Et | H | |
| 3a-60 | Cl | I | Et | H | |
| 3a-61 | Cl | CF ₃ | Et | H | |
| 3a-62 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |
| 3a-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 3a-64 | Cl | OMe | Et | H | |
| 3a-65 | Cl | NO ₂ | Et | H | |
| 3a-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | H | |
| 3a-67 | OMe | Me | Et | H | |
| 3a-68 | OMe | F | Et | H | |
| 3a-69 | OMe | Cl | Et | H | |
| 3a-70 | OMe | Br | Et | H | |
| 3a-71 | OMe | I | Et | H | |
| 3a-72 | OMe | CF ₃ | Et | H | |
| 3a-73 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 3a-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 3a-75 | OMe | OMe | Et | H | |
| 3a-76 | OMe | NO ₂ | Et | H | |
| 3a-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | H | |
| 3a-78 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 3a-79 | SO ₂ Me | F | Et | H | |
| 3a-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |
| 3a-81 | SO ₂ Me | Br | Et | H | |
| 3a-82 | SO ₂ Me | I | Et | H | |
| 3a-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |
| 3a-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 3a-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 3a-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | H | |
| 3a-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | H | |
| 3a-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | H | |

[0202]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 3a-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

[0203]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 3a-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 3a-133 | Me | Me | Me | CN | |
| 3a-134 | Me | F | Me | CN | |
| 3a-135 | Me | Cl | Me | CN | |
| 3a-136 | Me | Br | Me | CN | |
| 3a-137 | Me | I | Me | CN | |
| 3a-138 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 3a-139 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 3a-140 | Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 3a-141 | Me | OMe | Me | CN | |
| 3a-142 | Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 3a-143 | Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 3a-144 | Cl | Me | Me | CN | |
| 3a-145 | Cl | F | Me | CN | |
| 3a-146 | Cl | Cl | Me | CN | |
| 3a-147 | Cl | Br | Me | CN | |
| 3a-148 | Cl | I | Me | CN | |
| 3a-149 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |
| 3a-150 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 3a-151 | Cl | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 3a-152 | Cl | OMe | Me | CN | |
| 3a-153 | Cl | NO ₂ | Me | CN | |
| 3a-154 | Cl | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 3a-155 | OMe | Me | Me | CN | |
| 3a-156 | OMe | F | Me | CN | |
| 3a-157 | OMe | Cl | Me | CN | |
| 3a-158 | OMe | Br | Me | CN | |
| 3a-159 | OMe | I | Me | CN | |
| 3a-160 | OMe | CF ₃ | Me | CN | |
| 3a-161 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 3a-162 | OMe | CF ₂ Cl | Me | CN | |

[0204]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 3a-163 | OMe | OMe | Me | CN | |
| 3a-164 | OMe | NO ₂ | Me | CN | |
| 3a-165 | OMe | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 3a-166 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 3a-167 | SO ₂ Me | F | Me | CN | |
| 3a-168 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |
| 3a-169 | SO ₂ Me | Br | Me | CN | |
| 3a-170 | SO ₂ Me | I | Me | CN | |
| 3a-171 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 3a-172 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 3a-173 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 3a-174 | SO ₂ Me | OMe | Me | CN | |
| 3a-175 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 3a-176 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 3a-177 | Me | Me | Et | CN | |
| 3a-178 | Me | F | Et | CN | |
| 3a-179 | Me | Cl | Et | CN | |
| 3a-180 | Me | Br | Et | CN | |
| 3a-181 | Me | I | Et | CN | |
| 3a-182 | Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 3a-183 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 3a-184 | Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 3a-185 | Me | OMe | Et | CN | |
| 3a-186 | Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 3a-187 | Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 3a-188 | Cl | Me | Et | CN | |
| 3a-189 | Cl | F | Et | CN | |
| 3a-190 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 3a-191 | Cl | Br | Et | CN | |
| 3a-192 | Cl | I | Et | CN | |
| 3a-193 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 3a-194 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |
| 3a-195 | Cl | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 3a-196 | Cl | OMe | Et | CN | |
| 3a-197 | Cl | NO ₂ | Et | CN | |
| 3a-198 | Cl | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 3a-199 | OMe | Me | Et | CN | |

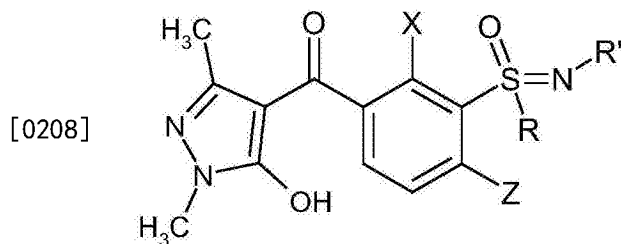
[0205]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 3a-200 | OMe | F | Et | CN | |
| 3a-201 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 3a-202 | OMe | Br | Et | CN | |
| 3a-203 | OMe | I | Et | CN | |
| 3a-204 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 3a-205 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |
| 3a-206 | OMe | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 3a-207 | OMe | OMe | Et | CN | |
| 3a-208 | OMe | NO ₂ | Et | CN | |
| 3a-209 | OMe | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 3a-210 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |
| 3a-211 | SO ₂ Me | F | Et | CN | |
| 3a-212 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 3a-213 | SO ₂ Me | Br | Et | CN | |
| 3a-214 | SO ₂ Me | I | Et | CN | |
| 3a-215 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 3a-216 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 3a-217 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 3a-218 | SO ₂ Me | OMe | Et | CN | |
| 3a-219 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 3a-220 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 3a-221 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-222 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-223 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-224 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-225 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-226 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-227 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-228 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-229 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-230 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-231 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-232 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-233 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-234 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-235 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-236 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0206]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 3a-237 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-238 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-239 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-240 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-241 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-242 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-243 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-244 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-245 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-246 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-247 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-248 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-249 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-250 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-251 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-252 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-253 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-254 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-255 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-256 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-257 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-258 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-259 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-260 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-261 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-262 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-263 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 3a-264 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0207] 表4: 本发明式(I)的化合物, 其中Q为Q3, Rⁱ和R^k各自为甲基, R^h和W各自为氢, t=1, 且其他基团具有表中指出的含义。



[0209]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|------|--------------------|--------------------|----|---|--|
| 4-1 | Me | Me | Me | H | |
| 4-2 | Me | F | Me | H | |
| 4-3 | Me | Cl | Me | H | |
| 4-4 | Me | Br | Me | H | |
| 4-5 | Me | I | Me | H | |
| 4-6 | Me | CF ₃ | Me | H | |
| 4-7 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 4-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 4-9 | Me | OMe | Me | H | |
| 4-10 | Me | NO ₂ | Me | H | |
| 4-11 | Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 4-12 | Cl | Me | Me | H | |
| 4-13 | Cl | F | Me | H | |
| 4-14 | Cl | Cl | Me | H | |
| 4-15 | Cl | Br | Me | H | |
| 4-16 | Cl | I | Me | H | |
| 4-17 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 4-18 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 4-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 4-20 | Cl | OMe | Me | H | |
| 4-21 | Cl | NO ₂ | Me | H | |
| 4-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | H | |
| 4-23 | OMe | Me | Me | H | |
| 4-24 | OMe | F | Me | H | |
| 4-25 | OMe | Cl | Me | H | |
| 4-26 | OMe | Br | Me | H | |
| 4-27 | OMe | I | Me | H | |
| 4-28 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 4-29 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |
| 4-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 4-31 | OMe | OMe | Me | H | |
| 4-32 | OMe | NO ₂ | Me | H | |
| 4-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | H | |
| 4-34 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 4-35 | SO ₂ Me | F | Me | H | |

[0210]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|--------------------|----|----|----|---------------------------|
| 4-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 4-37 | SO ₂ Me | Br | Me | H | |

| | | | | | |
|------|--------------------|--------------------|----|---|--|
| 4-38 | SO ₂ Me | I | Me | H | |
| 4-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 4-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 4-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 4-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | H | |
| 4-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | H | |
| 4-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 4-45 | Me | Me | Et | H | |
| 4-46 | Me | F | Et | H | |
| 4-47 | Me | Cl | Et | H | |
| 4-48 | Me | Br | Et | H | |
| 4-49 | Me | I | Et | H | |
| 4-50 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 4-51 | Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 4-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 4-53 | Me | OMe | Et | H | |
| 4-54 | Me | NO ₂ | Et | H | |
| 4-55 | Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 4-56 | Cl | Me | Et | H | |
| 4-57 | Cl | F | Et | H | |
| 4-58 | Cl | Cl | Et | H | |
| 4-59 | Cl | Br | Et | H | |
| 4-60 | Cl | I | Et | H | |
| 4-61 | Cl | CF ₃ | Et | H | |
| 4-62 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |
| 4-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 4-64 | Cl | OMe | Et | H | |
| 4-65 | Cl | NO ₂ | Et | H | |
| 4-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | H | |
| 4-67 | OMe | Me | Et | H | |
| 4-68 | OMe | F | Et | H | |
| 4-69 | OMe | Cl | Et | H | |
| 4-70 | OMe | Br | Et | H | |
| 4-71 | OMe | I | Et | H | |
| 4-72 | OMe | CF ₃ | Et | H | |

[0211]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|-----|--------------------|----|----|---------------------------|
| 4-73 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 4-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | H | |

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---|--|
| 4-75 | OMe | OMe | Et | H | |
| 4-76 | OMe | NO ₂ | Et | H | |
| 4-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | H | |
| 4-78 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 4-79 | SO ₂ Me | F | Et | H | |
| 4-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |
| 4-81 | SO ₂ Me | Br | Et | H | |
| 4-82 | SO ₂ Me | I | Et | H | |
| 4-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |
| 4-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 4-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 4-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | H | |
| 4-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | H | |
| 4-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 4-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

[0212]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|-----|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 4-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 4-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 4-133 | Me | Me | Me | CN | |
| 4-134 | Me | F | Me | CN | |
| 4-135 | Me | Cl | Me | CN | |
| 4-136 | Me | Br | Me | CN | |
| 4-137 | Me | I | Me | CN | |
| 4-138 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 4-139 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 4-140 | Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 4-141 | Me | OMe | Me | CN | |
| 4-142 | Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 4-143 | Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 4-144 | Cl | Me | Me | CN | |
| 4-145 | Cl | F | Me | CN | |
| 4-146 | Cl | Cl | Me | CN | |

[0213]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|--|
| 4-147 | Cl | Br | Me | CN | |
| 4-148 | Cl | I | Me | CN | |
| 4-149 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |
| 4-150 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 4-151 | Cl | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 4-152 | Cl | OMe | Me | CN | |
| 4-153 | Cl | NO ₂ | Me | CN | |
| 4-154 | Cl | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 4-155 | OMe | Me | Me | CN | |
| 4-156 | OMe | F | Me | CN | |
| 4-157 | OMe | Cl | Me | CN | |
| 4-158 | OMe | Br | Me | CN | |
| 4-159 | OMe | I | Me | CN | |
| 4-160 | OMe | CF ₃ | Me | CN | (400 MHz, CDCl ₃ δ, ppm) 7.85 (d,1H), 7.75 (d,1H), 4.03 (s,3H), 3.68 (s,3H), 3.65 (s,3H), 1.90 (s,3H) |
| 4-161 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 4-162 | OMe | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 4-163 | OMe | OMe | Me | CN | |
| 4-164 | OMe | NO ₂ | Me | CN | |
| 4-165 | OMe | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 4-166 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 4-167 | SO ₂ Me | F | Me | CN | |
| 4-168 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |
| 4-169 | SO ₂ Me | Br | Me | CN | |
| 4-170 | SO ₂ Me | I | Me | CN | |
| 4-171 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 4-172 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 4-173 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 4-174 | SO ₂ Me | OMe | Me | CN | |
| 4-175 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 4-176 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 4-177 | Me | Me | Et | CN | |
| 4-178 | Me | F | Et | CN | |
| 4-179 | Me | Cl | Et | CN | |
| 4-180 | Me | Br | Et | CN | |
| 4-181 | Me | I | Et | CN | |
| 4-182 | Me | CF ₃ | Et | CN | |

[0214]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 4-183 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 4-184 | Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 4-185 | Me | OMe | Et | CN | |
| 4-186 | Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 4-187 | Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 4-188 | Cl | Me | Et | CN | |
| 4-189 | Cl | F | Et | CN | |
| 4-190 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 4-191 | Cl | Br | Et | CN | |
| 4-192 | Cl | I | Et | CN | |
| 4-193 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 4-194 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |
| 4-195 | Cl | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 4-196 | Cl | OMe | Et | CN | |
| 4-197 | Cl | NO ₂ | Et | CN | |
| 4-198 | Cl | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 4-199 | OMe | Me | Et | CN | |
| 4-200 | OMe | F | Et | CN | |
| 4-201 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 4-202 | OMe | Br | Et | CN | |
| 4-203 | OMe | I | Et | CN | |
| 4-204 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 4-205 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |
| 4-206 | OMe | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 4-207 | OMe | OMe | Et | CN | |
| 4-208 | OMe | NO ₂ | Et | CN | |
| 4-209 | OMe | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 4-210 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |
| 4-211 | SO ₂ Me | F | Et | CN | |
| 4-212 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 4-213 | SO ₂ Me | Br | Et | CN | |
| 4-214 | SO ₂ Me | I | Et | CN | |
| 4-215 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 4-216 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 4-217 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 4-218 | SO ₂ Me | OMe | Et | CN | |
| 4-219 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | CN | |

[0215]

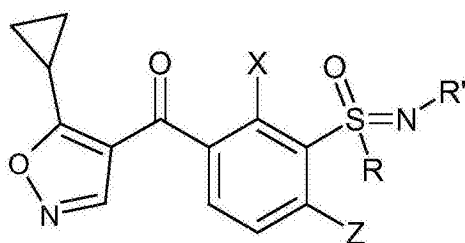
| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 4-220 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 4-221 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-222 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-223 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-224 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-225 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-226 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-227 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-228 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-229 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-230 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-231 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-232 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-233 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-234 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-235 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-236 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-237 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-238 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-239 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-240 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-241 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-242 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-243 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-244 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-245 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-246 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-247 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-248 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-249 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-250 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-251 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-252 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-253 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-254 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-255 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-256 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0216]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 4-257 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-258 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-259 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-260 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-261 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-262 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-263 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 4-264 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0217] 表5: 本发明式(I)的化合物, 其中Q为Q4, W为氢, t=1, 且其他基团具有表中指出的含义。

[0218]



[0219]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|----|--------------------|----|----|---------------------------|
| 5-1 | Me | Me | Me | H | |
| 5-2 | Me | F | Me | H | |
| 5-3 | Me | Cl | Me | H | |
| 5-4 | Me | Br | Me | H | |
| 5-5 | Me | I | Me | H | |
| 5-6 | Me | CF ₃ | Me | H | |
| 5-7 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 5-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 5-9 | Me | OMe | Me | H | |
| 5-10 | Me | NO ₂ | Me | H | |
| 5-11 | Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 5-12 | Cl | Me | Me | H | |
| 5-13 | Cl | F | Me | H | |
| 5-14 | Cl | Cl | Me | H | |
| 5-15 | Cl | Br | Me | H | |
| 5-16 | Cl | I | Me | H | |
| 5-17 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 5-18 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 5-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 5-20 | Cl | OMe | Me | H | |

[0220]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 5-21 | Cl | NO ₂ | Me | H | |
| 5-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | H | |
| 5-23 | OMe | Me | Me | H | |
| 5-24 | OMe | F | Me | H | |
| 5-25 | OMe | Cl | Me | H | |
| 5-26 | OMe | Br | Me | H | |
| 5-27 | OMe | I | Me | H | |
| 5-28 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 5-29 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |
| 5-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 5-31 | OMe | OMe | Me | H | |
| 5-32 | OMe | NO ₂ | Me | H | |
| 5-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | H | |
| 5-34 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 5-35 | SO ₂ Me | F | Me | H | |
| 5-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 5-37 | SO ₂ Me | Br | Me | H | |
| 5-38 | SO ₂ Me | I | Me | H | |
| 5-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 5-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 5-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 5-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | H | |
| 5-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | H | |
| 5-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 5-45 | Me | Me | Et | H | |
| 5-46 | Me | F | Et | H | |
| 5-47 | Me | Cl | Et | H | |
| 5-48 | Me | Br | Et | H | |
| 5-49 | Me | I | Et | H | |
| 5-50 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 5-51 | Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 5-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 5-53 | Me | OMe | Et | H | |
| 5-54 | Me | NO ₂ | Et | H | |
| 5-55 | Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 5-56 | Cl | Me | Et | H | |
| 5-57 | Cl | F | Et | H | |

[0221]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 5-58 | Cl | Cl | Et | H | |
| 5-59 | Cl | Br | Et | H | |
| 5-60 | Cl | I | Et | H | |
| 5-61 | Cl | CF ₃ | Et | H | |
| 5-62 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |
| 5-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 5-64 | Cl | OMe | Et | H | |
| 5-65 | Cl | NO ₂ | Et | H | |
| 5-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | H | |
| 5-67 | OMe | Me | Et | H | |
| 5-68 | OMe | F | Et | H | |
| 5-69 | OMe | Cl | Et | H | |
| 5-70 | OMe | Br | Et | H | |
| 5-71 | OMe | I | Et | H | |
| 5-72 | OMe | CF ₃ | Et | H | |
| 5-73 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 5-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 5-75 | OMe | OMe | Et | H | |
| 5-76 | OMe | NO ₂ | Et | H | |
| 5-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | H | |
| 5-78 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 5-79 | SO ₂ Me | F | Et | H | |
| 5-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |
| 5-81 | SO ₂ Me | Br | Et | H | |
| 5-82 | SO ₂ Me | I | Et | H | |
| 5-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |
| 5-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 5-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 5-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | H | |
| 5-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | H | |
| 5-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 5-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

[0222]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 5-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

[0223]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 5-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 5-133 | Me | Me | Me | CN | |
| 5-134 | Me | F | Me | CN | |
| 5-135 | Me | Cl | Me | CN | |
| 5-136 | Me | Br | Me | CN | |
| 5-137 | Me | I | Me | CN | |
| 5-138 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 5-139 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 5-140 | Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 5-141 | Me | OMe | Me | CN | |
| 5-142 | Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 5-143 | Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 5-144 | Cl | Me | Me | CN | |
| 5-145 | Cl | F | Me | CN | |
| 5-146 | Cl | Cl | Me | CN | |
| 5-147 | Cl | Br | Me | CN | |
| 5-148 | Cl | I | Me | CN | |
| 5-149 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |
| 5-150 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 5-151 | Cl | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 5-152 | Cl | OMe | Me | CN | |
| 5-153 | Cl | NO ₂ | Me | CN | |
| 5-154 | Cl | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 5-155 | OMe | Me | Me | CN | |
| 5-156 | OMe | F | Me | CN | |
| 5-157 | OMe | Cl | Me | CN | |
| 5-158 | OMe | Br | Me | CN | |
| 5-159 | OMe | I | Me | CN | |
| 5-160 | OMe | CF ₃ | Me | CN | |
| 5-161 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 5-162 | OMe | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 5-163 | OMe | OMe | Me | CN | |
| 5-164 | OMe | NO ₂ | Me | CN | |
| 5-165 | OMe | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 5-166 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 5-167 | SO ₂ Me | F | Me | CN | |
| 5-168 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |

[0224]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 5-169 | SO ₂ Me | Br | Me | CN | |
| 5-170 | SO ₂ Me | I | Me | CN | |
| 5-171 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 5-172 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 5-173 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 5-174 | SO ₂ Me | OMe | Me | CN | |
| 5-175 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 5-176 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 5-177 | Me | Me | Et | CN | |
| 5-178 | Me | F | Et | CN | |
| 5-179 | Me | Cl | Et | CN | |
| 5-180 | Me | Br | Et | CN | |
| 5-181 | Me | I | Et | CN | |
| 5-182 | Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 5-183 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 5-184 | Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 5-185 | Me | OMe | Et | CN | |
| 5-186 | Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 5-187 | Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 5-188 | Cl | Me | Et | CN | |
| 5-189 | Cl | F | Et | CN | |
| 5-190 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 5-191 | Cl | Br | Et | CN | |
| 5-192 | Cl | I | Et | CN | |
| 5-193 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 5-194 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |
| 5-195 | Cl | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 5-196 | Cl | OMe | Et | CN | |
| 5-197 | Cl | NO ₂ | Et | CN | |
| 5-198 | Cl | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 5-199 | OMe | Me | Et | CN | |
| 5-200 | OMe | F | Et | CN | |
| 5-201 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 5-202 | OMe | Br | Et | CN | |
| 5-203 | OMe | I | Et | CN | |
| 5-204 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 5-205 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |

[0225]

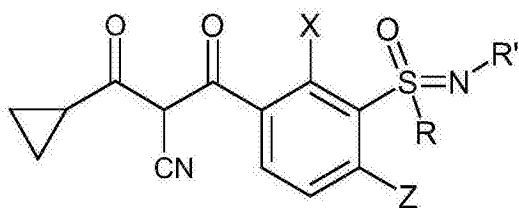
| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 5-206 | OMe | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 5-207 | OMe | OMe | Et | CN | |
| 5-208 | OMe | NO ₂ | Et | CN | |
| 5-209 | OMe | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 5-210 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |
| 5-211 | SO ₂ Me | F | Et | CN | |
| 5-212 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 5-213 | SO ₂ Me | Br | Et | CN | |
| 5-214 | SO ₂ Me | I | Et | CN | |
| 5-215 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 5-216 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 5-217 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 5-218 | SO ₂ Me | OMe | Et | CN | |
| 5-219 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 5-220 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 5-221 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-222 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-223 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-224 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-225 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-226 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-227 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-228 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-229 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-230 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-231 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-232 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-233 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-234 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-235 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-236 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-237 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-238 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-239 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-240 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-241 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-242 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0226]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 5-243 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-244 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-245 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-246 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-247 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-248 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-249 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-250 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-251 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-252 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-253 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-254 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-255 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-256 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-257 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-258 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-259 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-260 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-261 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-262 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-263 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 5-264 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0227] 表6: 本发明式(I)的化合物, 其中Q为Q5, W为氢, t=1, 且其他基团具有表中指出的含义。

[0228]



[0229]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-----|----|-----------------|----|----|---------------------------|
| 6-1 | Me | Me | Me | H | |
| 6-2 | Me | F | Me | H | |
| 6-3 | Me | Cl | Me | H | |
| 6-4 | Me | Br | Me | H | |
| 6-5 | Me | I | Me | H | |
| 6-6 | Me | CF ₃ | Me | H | |

| | | | | | |
|-----|----|------------------|----|---|--|
| 6-7 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
|-----|----|------------------|----|---|--|

[0230]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 6-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 6-9 | Me | OMe | Me | H | |
| 6-10 | Me | NO ₂ | Me | H | |
| 6-11 | Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 6-12 | Cl | Me | Me | H | |
| 6-13 | Cl | F | Me | H | |
| 6-14 | Cl | Cl | Me | H | |
| 6-15 | Cl | Br | Me | H | |
| 6-16 | Cl | I | Me | H | |
| 6-17 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 6-18 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 6-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 6-20 | Cl | OMe | Me | H | |
| 6-21 | Cl | NO ₂ | Me | H | |
| 6-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | H | |
| 6-23 | OMe | Me | Me | H | |
| 6-24 | OMe | F | Me | H | |
| 6-25 | OMe | Cl | Me | H | |
| 6-26 | OMe | Br | Me | H | |
| 6-27 | OMe | I | Me | H | |
| 6-28 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 6-29 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |
| 6-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 6-31 | OMe | OMe | Me | H | |
| 6-32 | OMe | NO ₂ | Me | H | |
| 6-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | H | |
| 6-34 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 6-35 | SO ₂ Me | F | Me | H | |
| 6-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 6-37 | SO ₂ Me | Br | Me | H | |
| 6-38 | SO ₂ Me | I | Me | H | |
| 6-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 6-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 6-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 6-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | H | |
| 6-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | H | |

| | | | | | |
|------|--------------------|--------------------|----|---|--|
| 6-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | H | |
|------|--------------------|--------------------|----|---|--|

[0231]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 6-45 | Me | Me | Et | H | |
| 6-46 | Me | F | Et | H | |
| 6-47 | Me | Cl | Et | H | |
| 6-48 | Me | Br | Et | H | |
| 6-49 | Me | I | Et | H | |
| 6-50 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 6-51 | Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 6-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 6-53 | Me | OMe | Et | H | |
| 6-54 | Me | NO ₂ | Et | H | |
| 6-55 | Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 6-56 | Cl | Me | Et | H | |
| 6-57 | Cl | F | Et | H | |
| 6-58 | Cl | Cl | Et | H | |
| 6-59 | Cl | Br | Et | H | |
| 6-60 | Cl | I | Et | H | |
| 6-61 | Cl | CF ₃ | Et | H | |
| 6-62 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |
| 6-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 6-64 | Cl | OMe | Et | H | |
| 6-65 | Cl | NO ₂ | Et | H | |
| 6-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | H | |
| 6-67 | OMe | Me | Et | H | |
| 6-68 | OMe | F | Et | H | |
| 6-69 | OMe | Cl | Et | H | |
| 6-70 | OMe | Br | Et | H | |
| 6-71 | OMe | I | Et | H | |
| 6-72 | OMe | CF ₃ | Et | H | |
| 6-73 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 6-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 6-75 | OMe | OMe | Et | H | |
| 6-76 | OMe | NO ₂ | Et | H | |
| 6-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | H | |
| 6-78 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 6-79 | SO ₂ Me | F | Et | H | |
| 6-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |

| | | | | | |
|------|--------------------|----|----|---|--|
| 6-81 | SO ₂ Me | Br | Et | H | |
|------|--------------------|----|----|---|--|

[0232]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 6-82 | SO ₂ Me | I | Et | H | |
| 6-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |
| 6-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 6-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 6-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | H | |
| 6-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | H | |
| 6-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 6-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

| | | | | | |
|-------|-----|--------------------|-------------------------------------|---|--|
| 6-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
|-------|-----|--------------------|-------------------------------------|---|--|

[0233]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 6-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 6-133 | Me | Me | Me | CN | |
| 6-134 | Me | F | Me | CN | |
| 6-135 | Me | Cl | Me | CN | |
| 6-136 | Me | Br | Me | CN | |
| 6-137 | Me | I | Me | CN | |
| 6-138 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 6-139 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 6-140 | Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 6-141 | Me | OMe | Me | CN | |
| 6-142 | Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 6-143 | Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 6-144 | Cl | Me | Me | CN | |
| 6-145 | Cl | F | Me | CN | |
| 6-146 | Cl | Cl | Me | CN | |
| 6-147 | Cl | Br | Me | CN | |
| 6-148 | Cl | I | Me | CN | |
| 6-149 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |
| 6-150 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 6-151 | Cl | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 6-152 | Cl | OMe | Me | CN | |
| 6-153 | Cl | NO ₂ | Me | CN | |
| 6-154 | Cl | SO ₂ Me | Me | CN | |

| | | | | | |
|-------|-----|----|----|----|--|
| 6-155 | OMe | Me | Me | CN | |
|-------|-----|----|----|----|--|

[0234]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 6-156 | OMe | F | Me | CN | |
| 6-157 | OMe | Cl | Me | CN | |
| 6-158 | OMe | Br | Me | CN | |
| 6-159 | OMe | I | Me | CN | |
| 6-160 | OMe | CF ₃ | Me | CN | |
| 6-161 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 6-162 | OMe | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 6-163 | OMe | OMe | Me | CN | |
| 6-164 | OMe | NO ₂ | Me | CN | |
| 6-165 | OMe | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 6-166 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 6-167 | SO ₂ Me | F | Me | CN | |
| 6-168 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |
| 6-169 | SO ₂ Me | Br | Me | CN | |
| 6-170 | SO ₂ Me | I | Me | CN | |
| 6-171 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 6-172 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 6-173 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 6-174 | SO ₂ Me | OMe | Me | CN | |
| 6-175 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 6-176 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 6-177 | Me | Me | Et | CN | |
| 6-178 | Me | F | Et | CN | |
| 6-179 | Me | Cl | Et | CN | |
| 6-180 | Me | Br | Et | CN | |
| 6-181 | Me | I | Et | CN | |
| 6-182 | Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 6-183 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 6-184 | Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 6-185 | Me | OMe | Et | CN | |
| 6-186 | Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 6-187 | Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 6-188 | Cl | Me | Et | CN | |
| 6-189 | Cl | F | Et | CN | |
| 6-190 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 6-191 | Cl | Br | Et | CN | |

| | | | | | |
|-------|----|---|----|----|--|
| 6-192 | Cl | I | Et | CN | |
|-------|----|---|----|----|--|

[0235]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 6-193 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 6-194 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |
| 6-195 | Cl | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 6-196 | Cl | OMe | Et | CN | |
| 6-197 | Cl | NO ₂ | Et | CN | |
| 6-198 | Cl | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 6-199 | OMe | Me | Et | CN | |
| 6-200 | OMe | F | Et | CN | |
| 6-201 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 6-202 | OMe | Br | Et | CN | |
| 6-203 | OMe | I | Et | CN | |
| 6-204 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 6-205 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |
| 6-206 | OMe | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 6-207 | OMe | OMe | Et | CN | |
| 6-208 | OMe | NO ₂ | Et | CN | |
| 6-209 | OMe | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 6-210 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |
| 6-211 | SO ₂ Me | F | Et | CN | |
| 6-212 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 6-213 | SO ₂ Me | Br | Et | CN | |
| 6-214 | SO ₂ Me | I | Et | CN | |
| 6-215 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 6-216 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 6-217 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 6-218 | SO ₂ Me | OMe | Et | CN | |
| 6-219 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 6-220 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 6-221 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-222 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-223 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-224 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-225 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-226 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-227 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-228 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

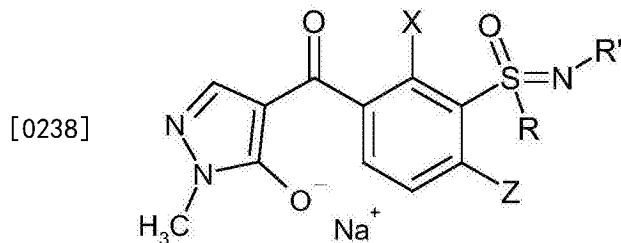
| | | | | | |
|-------|----|-----|-------------------------------------|----|--|
| 6-229 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
|-------|----|-----|-------------------------------------|----|--|

[0236]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 6-230 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-231 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-232 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-233 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-234 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-235 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-236 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-237 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-238 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-239 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-240 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-241 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-242 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-243 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-244 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-245 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-246 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-247 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-248 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-249 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-250 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-251 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-252 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-253 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-254 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-255 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-256 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-257 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-258 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-259 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-260 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-261 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-262 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-263 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 6-264 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0237] 表7:本发明以钠盐形式存在的式(I)的化合物,其中Q为Q3,R¹为甲基,R^k和W各自为

氢, $t=1$, 且其他基团具有表中指出的含义。



[0239]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|--------------------|------------------|----|----|---------------------------|
| 7-1 | Me | Me | Me | H | |
| 7-2 | Me | Cl | Me | H | |
| 7-3 | Me | CF ₃ | Me | H | |
| 7-4 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 7-5 | Cl | Me | Me | H | |
| 7-6 | Cl | Cl | Me | H | |
| 7-7 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 7-8 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 7-9 | OMe | Me | Me | H | |
| 7-10 | OMe | Cl | Me | H | |
| 7-11 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 7-12 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |
| 7-13 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 7-14 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 7-15 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 7-16 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 7-17 | Me | Me | Et | H | |
| 7-18 | Me | Cl | Et | H | |
| 7-19 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 7-20 | Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 7-21 | Cl | Me | Et | H | |
| 7-22 | Cl | Cl | Et | H | |
| 7-23 | Cl | CF ₃ | Et | H | |
| 7-24 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |
| 7-25 | OMe | Me | Et | H | |
| 7-26 | OMe | Cl | Et | H | |
| 7-27 | OMe | CF ₃ | Et | H | |
| 7-28 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 7-29 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 7-30 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |

[0240]

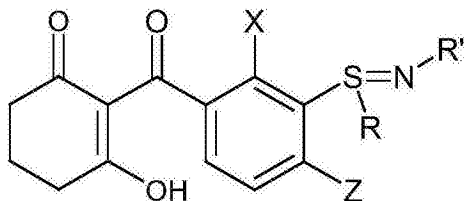
| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|--------------------|------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 7-31 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |
| 7-32 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 7-33 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-34 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-35 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-36 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-37 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-38 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-39 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-40 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-41 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-42 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-43 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-44 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-45 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-46 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-47 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-48 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 7-49 | Me | Me | Me | CN | |
| 7-50 | Me | Cl | Me | CN | |
| 7-51 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 7-52 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 7-53 | Cl | Me | Me | CN | |
| 7-54 | Cl | Cl | Me | CN | |
| 7-55 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |
| 7-56 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 7-57 | OMe | Me | Me | CN | |
| 7-58 | OMe | Cl | Me | CN | |
| 7-59 | OMe | CF ₃ | Me | CN | |
| 7-60 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 7-61 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 7-62 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |
| 7-63 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 7-64 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 7-65 | Me | Me | Et | CN | |
| 7-66 | Me | Cl | Et | CN | |
| 7-67 | Me | CF ₃ | Et | CN | |

[0241]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|--------------------|------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 7-68 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 7-69 | Cl | Me | Et | CN | |
| 7-70 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 7-71 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 7-72 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |
| 7-73 | OMe | Me | Et | CN | |
| 7-74 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 7-75 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 7-76 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |
| 7-77 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |
| 7-78 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 7-79 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 7-80 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 7-81 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 7-82 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 7-83 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 7-84 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 7-85 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 7-86 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 7-87 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 7-88 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 7-89 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 7-90 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 7-91 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 7-92 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 7-93 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 7-94 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 7-95 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 7-96 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0242] 表8:本发明式(I)的化合物,其中Q为Q1,R^a为羟基,基团R^b、R^c、R^d、R^e、R^f、R^g和W各自为氢,t=0,且其他基团具有表中指出的含义。

[0243]



[0244]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|------|--------------------|--------------------|----|---|--|
| 8-1 | Me | Me | Me | H | |
| 8-2 | Me | F | Me | H | |
| 8-3 | Me | Cl | Me | H | |
| 8-4 | Me | Br | Me | H | |
| 8-5 | Me | I | Me | H | |
| 8-6 | Me | CF ₃ | Me | H | |
| 8-7 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 8-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 8-9 | Me | OMe | Me | H | |
| 8-10 | Me | NO ₂ | Me | H | |
| 8-11 | Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 8-12 | Cl | Me | Me | H | |
| 8-13 | Cl | F | Me | H | |
| 8-14 | Cl | Cl | Me | H | |
| 8-15 | Cl | Br | Me | H | |
| 8-16 | Cl | I | Me | H | |
| 8-17 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 8-18 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 8-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 8-20 | Cl | OMe | Me | H | |
| 8-21 | Cl | NO ₂ | Me | H | |
| 8-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | H | |
| 8-23 | OMe | Me | Me | H | |
| 8-24 | OMe | F | Me | H | |
| 8-25 | OMe | Cl | Me | H | |
| 8-26 | OMe | Br | Me | H | |
| 8-27 | OMe | I | Me | H | |
| 8-28 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 8-29 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |
| 8-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 8-31 | OMe | OMe | Me | H | |
| 8-32 | OMe | NO ₂ | Me | H | |
| 8-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | H | |
| 8-34 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 8-35 | SO ₂ Me | F | Me | H | |
| 8-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 8-37 | SO ₂ Me | Br | Me | H | |

[0245]

| | | | | | |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|------|--------------------|--------------------|----|---|--|
| 8-38 | SO ₂ Me | I | Me | H | |
| 8-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 8-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 8-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 8-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | H | |
| 8-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | H | |
| 8-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 8-45 | Me | Me | Et | H | |
| 8-46 | Me | F | Et | H | |
| 8-47 | Me | Cl | Et | H | |
| 8-48 | Me | Br | Et | H | |
| 8-49 | Me | I | Et | H | |
| 8-50 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 8-51 | Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 8-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 8-53 | Me | OMe | Et | H | |
| 8-54 | Me | NO ₂ | Et | H | |
| 8-55 | Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 8-56 | Cl | Me | Et | H | |
| 8-57 | Cl | F | Et | H | |
| 8-58 | Cl | Cl | Et | H | |
| 8-59 | Cl | Br | Et | H | |
| 8-60 | Cl | I | Et | H | |
| 8-61 | Cl | CF ₃ | Et | H | |
| 8-62 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |
| 8-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 8-64 | Cl | OMe | Et | H | |
| 8-65 | Cl | NO ₂ | Et | H | |
| 8-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | H | |
| 8-67 | OMe | Me | Et | H | |
| 8-68 | OMe | F | Et | H | |
| 8-69 | OMe | Cl | Et | H | |
| 8-70 | OMe | Br | Et | H | |
| 8-71 | OMe | I | Et | H | |
| 8-72 | OMe | CF ₃ | Et | H | |
| 8-73 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 8-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | H | |

[0246]

| | | | | | |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---|--|
| 8-75 | OMe | OMe | Et | H | |
| 8-76 | OMe | NO ₂ | Et | H | |
| 8-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | H | |
| 8-78 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 8-79 | SO ₂ Me | F | Et | H | |
| 8-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |
| 8-81 | SO ₂ Me | Br | Et | H | |
| 8-82 | SO ₂ Me | I | Et | H | |
| 8-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |
| 8-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 8-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 8-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | H | |
| 8-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | H | |
| 8-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 8-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

[0247]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 8-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 8-133 | Me | Me | Me | CN | |
| 8-134 | Me | F | Me | CN | |
| 8-135 | Me | Cl | Me | CN | |
| 8-136 | Me | Br | Me | CN | |
| 8-137 | Me | I | Me | CN | |
| 8-138 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 8-139 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 8-140 | Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 8-141 | Me | OMe | Me | CN | |
| 8-142 | Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 8-143 | Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 8-144 | Cl | Me | Me | CN | |
| 8-145 | Cl | F | Me | CN | |
| 8-146 | Cl | Cl | Me | CN | |
| 8-147 | Cl | Br | Me | CN | |
| 8-148 | Cl | I | Me | CN | |

[0248]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|--|
| 8-149 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |
| 8-150 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 8-151 | Cl | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 8-152 | Cl | OMe | Me | CN | |
| 8-153 | Cl | NO ₂ | Me | CN | |
| 8-154 | Cl | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 8-155 | OMe | Me | Me | CN | |
| 8-156 | OMe | F | Me | CN | |
| 8-157 | OMe | Cl | Me | CN | |
| 8-158 | OMe | Br | Me | CN | |
| 8-159 | OMe | I | Me | CN | |
| 8-160 | OMe | CF ₃ | Me | CN | |
| 8-161 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 8-162 | OMe | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 8-163 | OMe | OMe | Me | CN | |
| 8-164 | OMe | NO ₂ | Me | CN | |
| 8-165 | OMe | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 8-166 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 8-167 | SO ₂ Me | F | Me | CN | |
| 8-168 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |
| 8-169 | SO ₂ Me | Br | Me | CN | |
| 8-170 | SO ₂ Me | I | Me | CN | |
| 8-171 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 8-172 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 8-173 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 8-174 | SO ₂ Me | OMe | Me | CN | |
| 8-175 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 8-176 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 8-177 | Me | Me | Et | CN | |
| 8-178 | Me | F | Et | CN | |
| 8-179 | Me | Cl | Et | CN | |
| 8-180 | Me | Br | Et | CN | |
| 8-181 | Me | I | Et | CN | |
| 8-182 | Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 8-183 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 8-184 | Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 8-185 | Me | OMe | Et | CN | |

[0249]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 8-186 | Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 8-187 | Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 8-188 | Cl | Me | Et | CN | |
| 8-189 | Cl | F | Et | CN | |
| 8-190 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 8-191 | Cl | Br | Et | CN | |
| 8-192 | Cl | I | Et | CN | |
| 8-193 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 8-194 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |
| 8-195 | Cl | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 8-196 | Cl | OMe | Et | CN | |
| 8-197 | Cl | NO ₂ | Et | CN | |
| 8-198 | Cl | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 8-199 | OMe | Me | Et | CN | |
| 8-200 | OMe | F | Et | CN | |
| 8-201 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 8-202 | OMe | Br | Et | CN | |
| 8-203 | OMe | I | Et | CN | |
| 8-204 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 8-205 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |
| 8-206 | OMe | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 8-207 | OMe | OMe | Et | CN | |
| 8-208 | OMe | NO ₂ | Et | CN | |
| 8-209 | OMe | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 8-210 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |
| 8-211 | SO ₂ Me | F | Et | CN | |
| 8-212 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 8-213 | SO ₂ Me | Br | Et | CN | |
| 8-214 | SO ₂ Me | I | Et | CN | |
| 8-215 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 8-216 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 8-217 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 8-218 | SO ₂ Me | OMe | Et | CN | |
| 8-219 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 8-220 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 8-221 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-222 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0250]

| | | | | | |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|

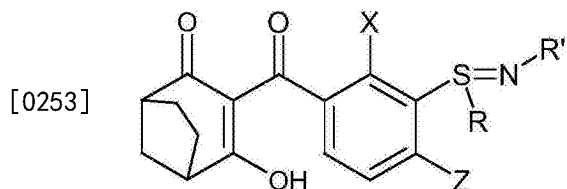
| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 8-223 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-224 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-225 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-226 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-227 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-228 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-229 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-230 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-231 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-232 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-233 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-234 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-235 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-236 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-237 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-238 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-239 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-240 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-241 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-242 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-243 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-244 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-245 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-246 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-247 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-248 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-249 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-250 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-251 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-252 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-253 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-254 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-255 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-256 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-257 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-258 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-259 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0251]

| | | | | | |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 8-260 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-261 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-262 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-263 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 8-264 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0252] 表9:本发明式(I)的化合物,其中Q为Q2,R^a为羟基,R^b、R^f和W各自为氢,A为CH₂CH₂,Y为CH₂,t=0,且其他基团具有表中指出的含义。



[0254]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|-----|--------------------|----|----|---------------------------|
| 9-1 | Me | Me | Me | H | |
| 9-2 | Me | F | Me | H | |
| 9-3 | Me | Cl | Me | H | |
| 9-4 | Me | Br | Me | H | |
| 9-5 | Me | I | Me | H | |
| 9-6 | Me | CF ₃ | Me | H | |
| 9-7 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 9-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 9-9 | Me | OMe | Me | H | |
| 9-10 | Me | NO ₂ | Me | H | |
| 9-11 | Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 9-12 | Cl | Me | Me | H | |
| 9-13 | Cl | F | Me | H | |
| 9-14 | Cl | Cl | Me | H | |
| 9-15 | Cl | Br | Me | H | |
| 9-16 | Cl | I | Me | H | |
| 9-17 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 9-18 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 9-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 9-20 | Cl | OMe | Me | H | |
| 9-21 | Cl | NO ₂ | Me | H | |
| 9-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | H | |
| 9-23 | OMe | Me | Me | H | |

[0255]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|-----|---|----|----|---------------------------|
| 9-24 | OMe | F | Me | H | |

| | | | | | |
|------|--------------------|--------------------|----|---|--|
| 9-25 | OMe | Cl | Me | H | |
| 9-26 | OMe | Br | Me | H | |
| 9-27 | OMe | I | Me | H | |
| 9-28 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 9-29 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |
| 9-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 9-31 | OMe | OMe | Me | H | |
| 9-32 | OMe | NO ₂ | Me | H | |
| 9-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | H | |
| 9-34 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 9-35 | SO ₂ Me | F | Me | H | |
| 9-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 9-37 | SO ₂ Me | Br | Me | H | |
| 9-38 | SO ₂ Me | I | Me | H | |
| 9-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 9-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 9-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 9-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | H | |
| 9-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | H | |
| 9-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 9-45 | Me | Me | Et | H | |
| 9-46 | Me | F | Et | H | |
| 9-47 | Me | Cl | Et | H | |
| 9-48 | Me | Br | Et | H | |
| 9-49 | Me | I | Et | H | |
| 9-50 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 9-51 | Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 9-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 9-53 | Me | OMe | Et | H | |
| 9-54 | Me | NO ₂ | Et | H | |
| 9-55 | Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 9-56 | Cl | Me | Et | H | |
| 9-57 | Cl | F | Et | H | |
| 9-58 | Cl | Cl | Et | H | |
| 9-59 | Cl | Br | Et | H | |
| 9-60 | Cl | I | Et | H | |

[0256]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|----|-----------------|----|----|---------------------------|
| 9-61 | Cl | CF ₃ | Et | H | |

| | | | | | |
|------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---|--|
| 9-62 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |
| 9-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 9-64 | Cl | OMe | Et | H | |
| 9-65 | Cl | NO ₂ | Et | H | |
| 9-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | H | |
| 9-67 | OMe | Me | Et | H | |
| 9-68 | OMe | F | Et | H | |
| 9-69 | OMe | Cl | Et | H | |
| 9-70 | OMe | Br | Et | H | |
| 9-71 | OMe | I | Et | H | |
| 9-72 | OMe | CF ₃ | Et | H | |
| 9-73 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 9-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 9-75 | OMe | OMe | Et | H | |
| 9-76 | OMe | NO ₂ | Et | H | |
| 9-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | H | |
| 9-78 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 9-79 | SO ₂ Me | F | Et | H | |
| 9-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |
| 9-81 | SO ₂ Me | Br | Et | H | |
| 9-82 | SO ₂ Me | I | Et | H | |
| 9-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |
| 9-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 9-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 9-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | H | |
| 9-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | H | |
| 9-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 9-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

[0257]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|----|-----------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 9-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 9-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 9-133 | Me | Me | Me | CN | |
| 9-134 | Me | F | Me | CN | |

[0258]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|----|----|----|----|---------------------------|
| 9-135 | Me | Cl | Me | CN | |

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|--|
| 9-136 | Me | Br | Me | CN | |
| 9-137 | Me | I | Me | CN | |
| 9-138 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 9-139 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 9-140 | Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 9-141 | Me | OMe | Me | CN | |
| 9-142 | Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 9-143 | Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 9-144 | Cl | Me | Me | CN | |
| 9-145 | Cl | F | Me | CN | |
| 9-146 | Cl | Cl | Me | CN | |
| 9-147 | Cl | Br | Me | CN | |
| 9-148 | Cl | I | Me | CN | |
| 9-149 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |
| 9-150 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 9-151 | Cl | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 9-152 | Cl | OMe | Me | CN | |
| 9-153 | Cl | NO ₂ | Me | CN | |
| 9-154 | Cl | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 9-155 | OMe | Me | Me | CN | |
| 9-156 | OMe | F | Me | CN | |
| 9-157 | OMe | Cl | Me | CN | |
| 9-158 | OMe | Br | Me | CN | |
| 9-159 | OMe | I | Me | CN | |
| 9-160 | OMe | CF ₃ | Me | CN | |
| 9-161 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 9-162 | OMe | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 9-163 | OMe | OMe | Me | CN | |
| 9-164 | OMe | NO ₂ | Me | CN | |
| 9-165 | OMe | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 9-166 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 9-167 | SO ₂ Me | F | Me | CN | |
| 9-168 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |
| 9-169 | SO ₂ Me | Br | Me | CN | |
| 9-170 | SO ₂ Me | I | Me | CN | |
| 9-171 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |

[0259]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|------------------|----|----|---------------------------|
| 9-172 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|--|
| 9-173 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 9-174 | SO ₂ Me | OMe | Me | CN | |
| 9-175 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 9-176 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 9-177 | Me | Me | Et | CN | |
| 9-178 | Me | F | Et | CN | |
| 9-179 | Me | Cl | Et | CN | |
| 9-180 | Me | Br | Et | CN | |
| 9-181 | Me | I | Et | CN | |
| 9-182 | Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 9-183 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 9-184 | Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 9-185 | Me | OMe | Et | CN | |
| 9-186 | Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 9-187 | Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 9-188 | Cl | Me | Et | CN | |
| 9-189 | Cl | F | Et | CN | |
| 9-190 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 9-191 | Cl | Br | Et | CN | |
| 9-192 | Cl | I | Et | CN | |
| 9-193 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 9-194 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |
| 9-195 | Cl | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 9-196 | Cl | OMe | Et | CN | |
| 9-197 | Cl | NO ₂ | Et | CN | |
| 9-198 | Cl | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 9-199 | OMe | Me | Et | CN | |
| 9-200 | OMe | F | Et | CN | |
| 9-201 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 9-202 | OMe | Br | Et | CN | |
| 9-203 | OMe | I | Et | CN | |
| 9-204 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 9-205 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |
| 9-206 | OMe | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 9-207 | OMe | OMe | Et | CN | |
| 9-208 | OMe | NO ₂ | Et | CN | |

[0260]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|-----|--------------------|----|----|---------------------------|
| 9-209 | OMe | SO ₂ Me | Et | CN | |

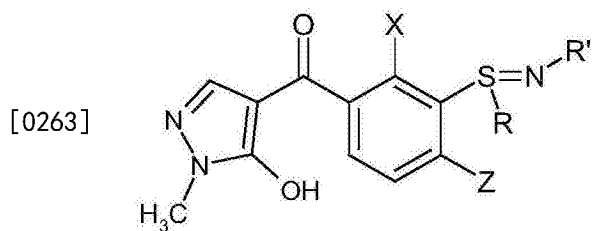
| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 9-210 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |
| 9-211 | SO ₂ Me | F | Et | CN | |
| 9-212 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 9-213 | SO ₂ Me | Br | Et | CN | |
| 9-214 | SO ₂ Me | I | Et | CN | |
| 9-215 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 9-216 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 9-217 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 9-218 | SO ₂ Me | OMe | Et | CN | |
| 9-219 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 9-220 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 9-221 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-222 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-223 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-224 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-225 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-226 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-227 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-228 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-229 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-230 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-231 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-232 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-233 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-234 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-235 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-236 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-237 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-238 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-239 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-240 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-241 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-242 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-243 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-244 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-245 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0261]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|-----|----|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 9-246 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 9-247 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-248 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-249 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-250 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-251 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-252 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-253 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-254 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-255 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-256 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-257 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-258 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-259 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-260 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-261 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-262 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-263 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 9-264 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0262] 表10:本发明式(I)的化合物,其中Q为Q3,Rⁱ为甲基,R^h、R^k和W各自为氢,t=0,且其他基团具有表中指出的含义。



[0264]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|----|--------------------|----|----|---------------------------|
| 10-1 | Me | Me | Me | H | |
| 10-2 | Me | F | Me | H | |
| 10-3 | Me | Cl | Me | H | |
| 10-4 | Me | Br | Me | H | |
| 10-5 | Me | I | Me | H | |
| 10-6 | Me | CF ₃ | Me | H | |
| 10-7 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 10-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 10-9 | Me | OMe | Me | H | |

[0265]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|----|-----------------|----|----|---------------------------|
| 10-10 | Me | NO ₂ | Me | H | |

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|----|---|--|
| 10-11 | Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 10-12 | Cl | Me | Me | H | |
| 10-13 | Cl | F | Me | H | |
| 10-14 | Cl | Cl | Me | H | |
| 10-15 | Cl | Br | Me | H | |
| 10-16 | Cl | I | Me | H | |
| 10-17 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 10-18 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 10-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 10-20 | Cl | OMe | Me | H | |
| 10-21 | Cl | NO ₂ | Me | H | |
| 10-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | H | |
| 10-23 | OMe | Me | Me | H | |
| 10-24 | OMe | F | Me | H | |
| 10-25 | OMe | Cl | Me | H | |
| 10-26 | OMe | Br | Me | H | |
| 10-27 | OMe | I | Me | H | |
| 10-28 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 10-29 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |
| 10-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 10-31 | OMe | OMe | Me | H | |
| 10-32 | OMe | NO ₂ | Me | H | |
| 10-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | H | |
| 10-34 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 10-35 | SO ₂ Me | F | Me | H | |
| 10-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 10-37 | SO ₂ Me | Br | Me | H | |
| 10-38 | SO ₂ Me | I | Me | H | |
| 10-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 10-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 10-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 10-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | H | |
| 10-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | H | |
| 10-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 10-45 | Me | Me | Et | H | |
| 10-46 | Me | F | Et | H | |

[0266]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|----|----|----|----|---------------------------|
| 10-47 | Me | Cl | Et | H | |

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|----|---|--|
| 10-48 | Me | Br | Et | H | |
| 10-49 | Me | I | Et | H | |
| 10-50 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 10-51 | Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 10-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 10-53 | Me | OMe | Et | H | |
| 10-54 | Me | NO ₂ | Et | H | |
| 10-55 | Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 10-56 | Cl | Me | Et | H | |
| 10-57 | Cl | F | Et | H | |
| 10-58 | Cl | Cl | Et | H | |
| 10-59 | Cl | Br | Et | H | |
| 10-60 | Cl | I | Et | H | |
| 10-61 | Cl | CF ₃ | Et | H | |
| 10-62 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |
| 10-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 10-64 | Cl | OMe | Et | H | |
| 10-65 | Cl | NO ₂ | Et | H | |
| 10-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | H | |
| 10-67 | OMe | Me | Et | H | |
| 10-68 | OMe | F | Et | H | |
| 10-69 | OMe | Cl | Et | H | |
| 10-70 | OMe | Br | Et | H | |
| 10-71 | OMe | I | Et | H | |
| 10-72 | OMe | CF ₃ | Et | H | |
| 10-73 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 10-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 10-75 | OMe | OMe | Et | H | |
| 10-76 | OMe | NO ₂ | Et | H | |
| 10-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | H | |
| 10-78 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 10-79 | SO ₂ Me | F | Et | H | |
| 10-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |
| 10-81 | SO ₂ Me | Br | Et | H | |
| 10-82 | SO ₂ Me | I | Et | H | |
| 10-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |

[0267]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|------------------|----|----|---------------------------|
| 10-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |

| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---|--|
| 10-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 10-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | H | |
| 10-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | H | |
| 10-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 10-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

[0268]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|-----|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 10-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 10-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10-133 | Me | Me | Me | CN | |
| 10-134 | Me | F | Me | CN | |
| 10-135 | Me | Cl | Me | CN | |
| 10-136 | Me | Br | Me | CN | |
| 10-137 | Me | I | Me | CN | |
| 10-138 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 10-139 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 10-140 | Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 10-141 | Me | OMe | Me | CN | |
| 10-142 | Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 10-143 | Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 10-144 | Cl | Me | Me | CN | |
| 10-145 | Cl | F | Me | CN | |
| 10-146 | Cl | Cl | Me | CN | |
| 10-147 | Cl | Br | Me | CN | |
| 10-148 | Cl | I | Me | CN | |
| 10-149 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |
| 10-150 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 10-151 | Cl | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 10-152 | Cl | OMe | Me | CN | |
| 10-153 | Cl | NO ₂ | Me | CN | |
| 10-154 | Cl | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 10-155 | OMe | Me | Me | CN | |
| 10-156 | OMe | F | Me | CN | |
| 10-157 | OMe | Cl | Me | CN | |

[0269]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|-----|----|----|----|---------------------------|
| 10-158 | OMe | Br | Me | CN | |

| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|----|----|--|
| 10-159 | OMe | I | Me | CN | |
| 10-160 | OMe | CF ₃ | Me | CN | |
| 10-161 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 10-162 | OMe | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 10-163 | OMe | OMe | Me | CN | |
| 10-164 | OMe | NO ₂ | Me | CN | |
| 10-165 | OMe | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 10-166 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 10-167 | SO ₂ Me | F | Me | CN | |
| 10-168 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |
| 10-169 | SO ₂ Me | Br | Me | CN | |
| 10-170 | SO ₂ Me | I | Me | CN | |
| 10-171 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 10-172 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 10-173 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 10-174 | SO ₂ Me | OMe | Me | CN | |
| 10-175 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 10-176 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 10-177 | Me | Me | Et | CN | |
| 10-178 | Me | F | Et | CN | |
| 10-179 | Me | Cl | Et | CN | |
| 10-180 | Me | Br | Et | CN | |
| 10-181 | Me | I | Et | CN | |
| 10-182 | Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 10-183 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 10-184 | Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 10-185 | Me | OMe | Et | CN | |
| 10-186 | Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 10-187 | Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 10-188 | Cl | Me | Et | CN | |
| 10-189 | Cl | F | Et | CN | |
| 10-190 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 10-191 | Cl | Br | Et | CN | |
| 10-192 | Cl | I | Et | CN | |
| 10-193 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 10-194 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |

[0270]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|----|--------------------|----|----|---------------------------|
| 10-195 | Cl | CF ₂ Cl | Et | CN | |

| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 10-196 | Cl | OMe | Et | CN | |
| 10-197 | Cl | NO ₂ | Et | CN | |
| 10-198 | Cl | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 10-199 | OMe | Me | Et | CN | |
| 10-200 | OMe | F | Et | CN | |
| 10-201 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 10-202 | OMe | Br | Et | CN | |
| 10-203 | OMe | I | Et | CN | |
| 10-204 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 10-205 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |
| 10-206 | OMe | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 10-207 | OMe | OMe | Et | CN | |
| 10-208 | OMe | NO ₂ | Et | CN | |
| 10-209 | OMe | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 10-210 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |
| 10-211 | SO ₂ Me | F | Et | CN | |
| 10-212 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 10-213 | SO ₂ Me | Br | Et | CN | |
| 10-214 | SO ₂ Me | I | Et | CN | |
| 10-215 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 10-216 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 10-217 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 10-218 | SO ₂ Me | OMe | Et | CN | |
| 10-219 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 10-220 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 10-221 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-222 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-223 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-224 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-225 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-226 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-227 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-228 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-229 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-230 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-231 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

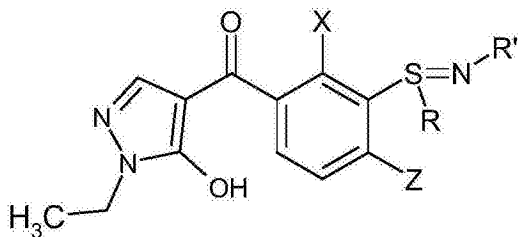
[0271]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|----|----|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 10-232 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 10-233 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-234 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-235 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-236 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-237 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-238 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-239 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-240 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-241 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-242 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-243 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-244 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-245 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-246 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-247 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-248 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-249 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-250 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-251 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-252 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-253 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-254 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-255 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-256 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-257 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-258 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-259 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-260 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-261 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-262 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-263 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10-264 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0272] 表10a:本发明式(I)的化合物,其中Q为Q3,Rⁱ为乙基,R^h、R^k和W各自为氢,t=0,且其他基团具有表中指出的含义。

[0273]



[0274]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|-----|--------------------|----|----|---------------------------|
| 10a-1 | Me | Me | Me | H | |
| 10a-2 | Me | F | Me | H | |
| 10a-3 | Me | Cl | Me | H | |
| 10a-4 | Me | Br | Me | H | |
| 10a-5 | Me | I | Me | H | |
| 10a-6 | Me | CF ₃ | Me | H | |
| 10a-7 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 10a-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 10a-9 | Me | OMe | Me | H | |
| 10a-10 | Me | NO ₂ | Me | H | |
| 10a-11 | Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 10a-12 | Cl | Me | Me | H | |
| 10a-13 | Cl | F | Me | H | |
| 10a-14 | Cl | Cl | Me | H | |
| 10a-15 | Cl | Br | Me | H | |
| 10a-16 | Cl | I | Me | H | |
| 10a-17 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 10a-18 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 10a-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 10a-20 | Cl | OMe | Me | H | |
| 10a-21 | Cl | NO ₂ | Me | H | |
| 10a-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | H | |
| 10a-23 | OMe | Me | Me | H | |
| 10a-24 | OMe | F | Me | H | |
| 10a-25 | OMe | Cl | Me | H | |
| 10a-26 | OMe | Br | Me | H | |
| 10a-27 | OMe | I | Me | H | |
| 10a-28 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 10a-29 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |
| 10a-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 10a-31 | OMe | OMe | Me | H | |
| 10a-32 | OMe | NO ₂ | Me | H | |

[0275]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 10a-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | H | |
| 10a-34 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 10a-35 | SO ₂ Me | F | Me | H | |

| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|----|---|--|
| 10a-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 10a-37 | SO ₂ Me | Br | Me | H | |
| 10a-38 | SO ₂ Me | I | Me | H | |
| 10a-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 10a-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 10a-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 10a-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | H | |
| 10a-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | H | |
| 10a-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 10a-45 | Me | Me | Et | H | |
| 10a-46 | Me | F | Et | H | |
| 10a-47 | Me | Cl | Et | H | |
| 10a-48 | Me | Br | Et | H | |
| 10a-49 | Me | I | Et | H | |
| 10a-50 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 10a-51 | Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 10a-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 10a-53 | Me | OMe | Et | H | |
| 10a-54 | Me | NO ₂ | Et | H | |
| 10a-55 | Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 10a-56 | Cl | Me | Et | H | |
| 10a-57 | Cl | F | Et | H | |
| 10a-58 | Cl | Cl | Et | H | |
| 10a-59 | Cl | Br | Et | H | |
| 10a-60 | Cl | I | Et | H | |
| 10a-61 | Cl | CF ₃ | Et | H | |
| 10a-62 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |
| 10a-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 10a-64 | Cl | OMe | Et | H | |
| 10a-65 | Cl | NO ₂ | Et | H | |
| 10a-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | H | |
| 10a-67 | OMe | Me | Et | H | |
| 10a-68 | OMe | F | Et | H | |
| 10a-69 | OMe | Cl | Et | H | |

[0276]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|-----|-----------------|----|----|---------------------------|
| 10a-70 | OMe | Br | Et | H | |
| 10a-71 | OMe | I | Et | H | |
| 10a-72 | OMe | CF ₃ | Et | H | |

| | | | | | |
|---------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---|--|
| 10a-73 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 10a-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 10a-75 | OMe | OMe | Et | H | |
| 10a-76 | OMe | NO ₂ | Et | H | |
| 10a-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | H | |
| 10a-78 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 10a-79 | SO ₂ Me | F | Et | H | |
| 10a-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |
| 10a-81 | SO ₂ Me | Br | Et | H | |
| 10a-82 | SO ₂ Me | I | Et | H | |
| 10a-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |
| 10a-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 10a-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 10a-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | H | |
| 10a-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | H | |
| 10a-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 10a-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

[0277]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|---------|----|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 10a-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

| | | | | | |
|---------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 10a-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 10a-133 | Me | Me | Me | CN | |
| 10a-134 | Me | F | Me | CN | |
| 10a-135 | Me | Cl | Me | CN | |
| 10a-136 | Me | Br | Me | CN | |
| 10a-137 | Me | I | Me | CN | |
| 10a-138 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 10a-139 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 10a-140 | Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 10a-141 | Me | OMe | Me | CN | |
| 10a-142 | Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 10a-143 | Me | SO ₂ Me | Me | CN | |

[0278]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|---------|--------------------|--------------------|----|----|---|
| 10a-144 | Cl | Me | Me | CN | |
| 10a-145 | Cl | F | Me | CN | |
| 10a-146 | Cl | Cl | Me | CN | |
| 10a-147 | Cl | Br | Me | CN | |
| 10a-148 | Cl | I | Me | CN | |
| 10a-149 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |
| 10a-150 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 10a-151 | Cl | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 10a-152 | Cl | OMe | Me | CN | |
| 10a-153 | Cl | NO ₂ | Me | CN | |
| 10a-154 | Cl | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 10a-155 | OMe | Me | Me | CN | |
| 10a-156 | OMe | F | Me | CN | |
| 10a-157 | OMe | Cl | Me | CN | |
| 10a-158 | OMe | Br | Me | CN | |
| 10a-159 | OMe | I | Me | CN | |
| 10a-160 | OMe | CF ₃ | Me | CN | (400 MHz, CDCl ₃ δ, ppm) 7.82 (d,1H), 7.61 (d,1H), 7.48 (s,1H), 4.12 (q,2H), 4.06 (s,3H), 3.36 (s,3H), 1.48 (t,3H) |
| 10a-161 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 10a-162 | OMe | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 10a-163 | OMe | OMe | Me | CN | |
| 10a-164 | OMe | NO ₂ | Me | CN | |
| 10a-165 | OMe | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 10a-166 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 10a-167 | SO ₂ Me | F | Me | CN | |
| 10a-168 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |
| 10a-169 | SO ₂ Me | Br | Me | CN | |
| 10a-170 | SO ₂ Me | I | Me | CN | |
| 10a-171 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 10a-172 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 10a-173 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 10a-174 | SO ₂ Me | OMe | Me | CN | |
| 10a-175 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 10a-176 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 10a-177 | Me | Me | Et | CN | |

[0279]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|---------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 10a-178 | Me | F | Et | CN | |
| 10a-179 | Me | Cl | Et | CN | |
| 10a-180 | Me | Br | Et | CN | |
| 10a-181 | Me | I | Et | CN | |
| 10a-182 | Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 10a-183 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 10a-184 | Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 10a-185 | Me | OMe | Et | CN | |
| 10a-186 | Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 10a-187 | Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 10a-188 | Cl | Me | Et | CN | |
| 10a-189 | Cl | F | Et | CN | |
| 10a-190 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 10a-191 | Cl | Br | Et | CN | |
| 10a-192 | Cl | I | Et | CN | |
| 10a-193 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 10a-194 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |
| 10a-195 | Cl | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 10a-196 | Cl | OMe | Et | CN | |
| 10a-197 | Cl | NO ₂ | Et | CN | |
| 10a-198 | Cl | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 10a-199 | OMe | Me | Et | CN | |
| 10a-200 | OMe | F | Et | CN | |
| 10a-201 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 10a-202 | OMe | Br | Et | CN | |
| 10a-203 | OMe | I | Et | CN | |
| 10a-204 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 10a-205 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |
| 10a-206 | OMe | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 10a-207 | OMe | OMe | Et | CN | |
| 10a-208 | OMe | NO ₂ | Et | CN | |
| 10a-209 | OMe | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 10a-210 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |
| 10a-211 | SO ₂ Me | F | Et | CN | |
| 10a-212 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 10a-213 | SO ₂ Me | Br | Et | CN | |
| 10a-214 | SO ₂ Me | I | Et | CN | |

[0280]

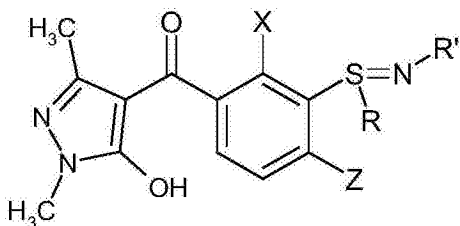
| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|---------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 10a-215 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 10a-216 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 10a-217 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 10a-218 | SO ₂ Me | OMe | Et | CN | |
| 10a-219 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 10a-220 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 10a-221 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-222 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-223 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-224 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-225 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-226 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-227 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-228 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-229 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-230 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-231 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-232 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-233 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-234 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-235 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-236 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-237 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-238 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-239 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-240 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-241 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-242 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-243 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-244 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-245 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-246 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-247 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-248 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-249 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-250 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-251 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0281]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|---------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 10a-252 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-253 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-254 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-255 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-256 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-257 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-258 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-259 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-260 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-261 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-262 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-263 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 10a-264 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0282] 表11:本发明式(I)的化合物,其中Q为Q3,Rⁱ和R^k各自为甲基,R^h和W各自为氢,t=0,且其他基团具有表中指出的含义。

[0283]



[0284]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|----|--------------------|----|----|---------------------------|
| 11-1 | Me | Me | Me | H | |
| 11-2 | Me | F | Me | H | |
| 11-3 | Me | Cl | Me | H | |
| 11-4 | Me | Br | Me | H | |
| 11-5 | Me | I | Me | H | |
| 11-6 | Me | CF ₃ | Me | H | |
| 11-7 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 11-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 11-9 | Me | OMe | Me | H | |
| 11-10 | Me | NO ₂ | Me | H | |
| 11-11 | Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 11-12 | Cl | Me | Me | H | |
| 11-13 | Cl | F | Me | H | |
| 11-14 | Cl | Cl | Me | H | |
| 11-15 | Cl | Br | Me | H | |

[0285]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 11-16 | Cl | I | Me | H | |
| 11-17 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 11-18 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 11-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 11-20 | Cl | OMe | Me | H | |
| 11-21 | Cl | NO ₂ | Me | H | |
| 11-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | H | |
| 11-23 | OMe | Me | Me | H | |
| 11-24 | OMe | F | Me | H | |
| 11-25 | OMe | Cl | Me | H | |
| 11-26 | OMe | Br | Me | H | |
| 11-27 | OMe | I | Me | H | |
| 11-28 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 11-29 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |
| 11-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 11-31 | OMe | OMe | Me | H | |
| 11-32 | OMe | NO ₂ | Me | H | |
| 11-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | H | |
| 11-34 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 11-35 | SO ₂ Me | F | Me | H | |
| 11-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 11-37 | SO ₂ Me | Br | Me | H | |
| 11-38 | SO ₂ Me | I | Me | H | |
| 11-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 11-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 11-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 11-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | H | |
| 11-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | H | |
| 11-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 11-45 | Me | Me | Et | H | |
| 11-46 | Me | F | Et | H | |
| 11-47 | Me | Cl | Et | H | |
| 11-48 | Me | Br | Et | H | |
| 11-49 | Me | I | Et | H | |
| 11-50 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 11-51 | Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 11-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | H | |

[0286]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 11-53 | Me | OMe | Et | H | |
| 11-54 | Me | NO ₂ | Et | H | |
| 11-55 | Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 11-56 | Cl | Me | Et | H | |
| 11-57 | Cl | F | Et | H | |
| 11-58 | Cl | Cl | Et | H | |
| 11-59 | Cl | Br | Et | H | |
| 11-60 | Cl | I | Et | H | |
| 11-61 | Cl | CF ₃ | Et | H | |
| 11-62 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |
| 11-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 11-64 | Cl | OMe | Et | H | |
| 11-65 | Cl | NO ₂ | Et | H | |
| 11-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | H | |
| 11-67 | OMe | Me | Et | H | |
| 11-68 | OMe | F | Et | H | |
| 11-69 | OMe | Cl | Et | H | |
| 11-70 | OMe | Br | Et | H | |
| 11-71 | OMe | I | Et | H | |
| 11-72 | OMe | CF ₃ | Et | H | |
| 11-73 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 11-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 11-75 | OMe | OMe | Et | H | |
| 11-76 | OMe | NO ₂ | Et | H | |
| 11-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | H | |
| 11-78 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 11-79 | SO ₂ Me | F | Et | H | |
| 11-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |
| 11-81 | SO ₂ Me | Br | Et | H | |
| 11-82 | SO ₂ Me | I | Et | H | |
| 11-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |
| 11-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 11-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 11-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | H | |
| 11-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | H | |
| 11-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 11-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

[0287]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 11-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

[0288]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 11-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 11-133 | Me | Me | Me | CN | |
| 11-134 | Me | F | Me | CN | |
| 11-135 | Me | Cl | Me | CN | |
| 11-136 | Me | Br | Me | CN | |
| 11-137 | Me | I | Me | CN | |
| 11-138 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 11-139 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 11-140 | Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 11-141 | Me | OMe | Me | CN | |
| 11-142 | Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 11-143 | Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 11-144 | Cl | Me | Me | CN | |
| 11-145 | Cl | F | Me | CN | |
| 11-146 | Cl | Cl | Me | CN | |
| 11-147 | Cl | Br | Me | CN | |
| 11-148 | Cl | I | Me | CN | |
| 11-149 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |
| 11-150 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 11-151 | Cl | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 11-152 | Cl | OMe | Me | CN | |
| 11-153 | Cl | NO ₂ | Me | CN | |
| 11-154 | Cl | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 11-155 | OMe | Me | Me | CN | |
| 11-156 | OMe | F | Me | CN | |
| 11-157 | OMe | Cl | Me | CN | |
| 11-158 | OMe | Br | Me | CN | |
| 11-159 | OMe | I | Me | CN | |
| 11-160 | OMe | CF ₃ | Me | CN | |
| 11-161 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 11-162 | OMe | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 11-163 | OMe | OMe | Me | CN | |

[0289]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|----|----|---------------------------|
| 11-164 | OMe | NO ₂ | Me | CN | |
| 11-165 | OMe | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 11-166 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 11-167 | SO ₂ Me | F | Me | CN | |
| 11-168 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |
| 11-169 | SO ₂ Me | Br | Me | CN | |
| 11-170 | SO ₂ Me | I | Me | CN | |
| 11-171 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 11-172 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 11-173 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 11-174 | SO ₂ Me | OMe | Me | CN | |
| 11-175 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 11-176 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 11-177 | Me | Me | Et | CN | |
| 11-178 | Me | F | Et | CN | |
| 11-179 | Me | Cl | Et | CN | |
| 11-180 | Me | Br | Et | CN | |
| 11-181 | Me | I | Et | CN | |
| 11-182 | Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 11-183 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 11-184 | Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 11-185 | Me | OMe | Et | CN | |
| 11-186 | Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 11-187 | Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 11-188 | Cl | Me | Et | CN | |
| 11-189 | Cl | F | Et | CN | |
| 11-190 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 11-191 | Cl | Br | Et | CN | |
| 11-192 | Cl | I | Et | CN | |
| 11-193 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 11-194 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |
| 11-195 | Cl | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 11-196 | Cl | OMe | Et | CN | |
| 11-197 | Cl | NO ₂ | Et | CN | |
| 11-198 | Cl | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 11-199 | OMe | Me | Et | CN | |
| 11-200 | OMe | F | Et | CN | |

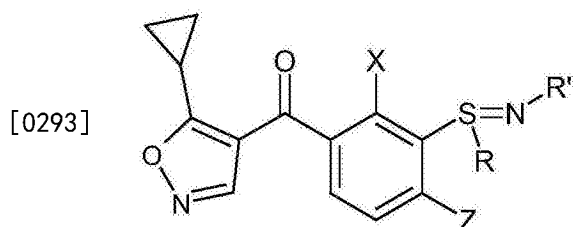
[0290]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 11-201 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 11-202 | OMe | Br | Et | CN | |
| 11-203 | OMe | I | Et | CN | |
| 11-204 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 11-205 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |
| 11-206 | OMe | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 11-207 | OMe | OMe | Et | CN | |
| 11-208 | OMe | NO ₂ | Et | CN | |
| 11-209 | OMe | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 11-210 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |
| 11-211 | SO ₂ Me | F | Et | CN | |
| 11-212 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 11-213 | SO ₂ Me | Br | Et | CN | |
| 11-214 | SO ₂ Me | I | Et | CN | |
| 11-215 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 11-216 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 11-217 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 11-218 | SO ₂ Me | OMe | Et | CN | |
| 11-219 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 11-220 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 11-221 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-222 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-223 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-224 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-225 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-226 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-227 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-228 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-229 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-230 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-231 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-232 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-233 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-234 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-235 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-236 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-237 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0291]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 11-238 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-239 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-240 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-241 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-242 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-243 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-244 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-245 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-246 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-247 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-248 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-249 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-250 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-251 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-252 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-253 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-254 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-255 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-256 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-257 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-258 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-259 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-260 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-261 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-262 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-263 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 11-264 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0292] 表12: 本发明式(I)的化合物, 其中Q为Q4, W为氢, t=0, 且其他基团具有表中指出的含义。



[0294]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|----|----|----|----|---------------------------|
| 12-1 | Me | Me | Me | H | |

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|----|---|--|
| 12-2 | Me | F | Me | H | |
| 12-3 | Me | Cl | Me | H | |
| 12-4 | Me | Br | Me | H | |
| 12-5 | Me | I | Me | H | |
| 12-6 | Me | CF ₃ | Me | H | |
| 12-7 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 12-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 12-9 | Me | OMe | Me | H | |
| 12-10 | Me | NO ₂ | Me | H | |
| 12-11 | Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 12-12 | Cl | Me | Me | H | |
| 12-13 | Cl | F | Me | H | |
| 12-14 | Cl | Cl | Me | H | |
| 12-15 | Cl | Br | Me | H | |
| 12-16 | Cl | I | Me | H | |
| 12-17 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 12-18 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 12-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 12-20 | Cl | OMe | Me | H | |
| 12-21 | Cl | NO ₂ | Me | H | |
| 12-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | H | |
| 12-23 | OMe | Me | Me | H | |
| 12-24 | OMe | F | Me | H | |
| 12-25 | OMe | Cl | Me | H | |
| 12-26 | OMe | Br | Me | H | |
| 12-27 | OMe | I | Me | H | |
| 12-28 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 12-29 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |
| 12-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 12-31 | OMe | OMe | Me | H | |
| 12-32 | OMe | NO ₂ | Me | H | |
| 12-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | H | |
| 12-34 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 12-35 | SO ₂ Me | F | Me | H | |
| 12-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 12-37 | SO ₂ Me | Br | Me | H | |

[0295]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|---|----|----|---------------------------|
| 12-38 | SO ₂ Me | I | Me | H | |

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|----|---|--|
| 12-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 12-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 12-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 12-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | H | |
| 12-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | H | |
| 12-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 12-45 | Me | Me | Et | H | |
| 12-46 | Me | F | Et | H | |
| 12-47 | Me | Cl | Et | H | |
| 12-48 | Me | Br | Et | H | |
| 12-49 | Me | I | Et | H | |
| 12-50 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 12-51 | Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 12-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 12-53 | Me | OMe | Et | H | |
| 12-54 | Me | NO ₂ | Et | H | |
| 12-55 | Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 12-56 | Cl | Me | Et | H | |
| 12-57 | Cl | F | Et | H | |
| 12-58 | Cl | Cl | Et | H | |
| 12-59 | Cl | Br | Et | H | |
| 12-60 | Cl | I | Et | H | |
| 12-61 | Cl | CF ₃ | Et | H | |
| 12-62 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |
| 12-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 12-64 | Cl | OMe | Et | H | |
| 12-65 | Cl | NO ₂ | Et | H | |
| 12-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | H | |
| 12-67 | OMe | Me | Et | H | |
| 12-68 | OMe | F | Et | H | |
| 12-69 | OMe | Cl | Et | H | |
| 12-70 | OMe | Br | Et | H | |
| 12-71 | OMe | I | Et | H | |
| 12-72 | OMe | CF ₃ | Et | H | |
| 12-73 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 12-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | H | |

[0296]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|-----|-----|----|----|---------------------------|
| 12-75 | OMe | OMe | Et | H | |

| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---|--|
| 12-76 | OMe | NO ₂ | Et | H | |
| 12-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | H | |
| 12-78 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 12-79 | SO ₂ Me | F | Et | H | |
| 12-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |
| 12-81 | SO ₂ Me | Br | Et | H | |
| 12-82 | SO ₂ Me | I | Et | H | |
| 12-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |
| 12-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 12-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 12-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | H | |
| 12-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | H | |
| 12-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 12-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

[0297]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|-----|---|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 12-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 12-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 12-133 | Me | Me | Me | CN | |
| 12-134 | Me | F | Me | CN | |
| 12-135 | Me | Cl | Me | CN | |
| 12-136 | Me | Br | Me | CN | |
| 12-137 | Me | I | Me | CN | |
| 12-138 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 12-139 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 12-140 | Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 12-141 | Me | OMe | Me | CN | |
| 12-142 | Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 12-143 | Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 12-144 | Cl | Me | Me | CN | |
| 12-145 | Cl | F | Me | CN | |
| 12-146 | Cl | Cl | Me | CN | |
| 12-147 | Cl | Br | Me | CN | |
| 12-148 | Cl | I | Me | CN | |

[0298]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|----|-----------------|----|----|---------------------------|
| 12-149 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |

| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|----|----|--|
| 12-150 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 12-151 | Cl | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 12-152 | Cl | OMe | Me | CN | |
| 12-153 | Cl | NO ₂ | Me | CN | |
| 12-154 | Cl | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 12-155 | OMe | Me | Me | CN | |
| 12-156 | OMe | F | Me | CN | |
| 12-157 | OMe | Cl | Me | CN | |
| 12-158 | OMe | Br | Me | CN | |
| 12-159 | OMe | I | Me | CN | |
| 12-160 | OMe | CF ₃ | Me | CN | |
| 12-161 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 12-162 | OMe | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 12-163 | OMe | OMe | Me | CN | |
| 12-164 | OMe | NO ₂ | Me | CN | |
| 12-165 | OMe | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 12-166 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 12-167 | SO ₂ Me | F | Me | CN | |
| 12-168 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |
| 12-169 | SO ₂ Me | Br | Me | CN | |
| 12-170 | SO ₂ Me | I | Me | CN | |
| 12-171 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 12-172 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 12-173 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 12-174 | SO ₂ Me | OMe | Me | CN | |
| 12-175 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 12-176 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 12-177 | Me | Me | Et | CN | |
| 12-178 | Me | F | Et | CN | |
| 12-179 | Me | Cl | Et | CN | |
| 12-180 | Me | Br | Et | CN | |
| 12-181 | Me | I | Et | CN | |
| 12-182 | Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 12-183 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 12-184 | Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 12-185 | Me | OMe | Et | CN | |

[0299]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|----|-----------------|----|----|---------------------------|
| 12-186 | Me | NO ₂ | Et | CN | |

| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 12-187 | Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 12-188 | Cl | Me | Et | CN | |
| 12-189 | Cl | F | Et | CN | |
| 12-190 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 12-191 | Cl | Br | Et | CN | |
| 12-192 | Cl | I | Et | CN | |
| 12-193 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 12-194 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |
| 12-195 | Cl | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 12-196 | Cl | OMe | Et | CN | |
| 12-197 | Cl | NO ₂ | Et | CN | |
| 12-198 | Cl | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 12-199 | OMe | Me | Et | CN | |
| 12-200 | OMe | F | Et | CN | |
| 12-201 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 12-202 | OMe | Br | Et | CN | |
| 12-203 | OMe | I | Et | CN | |
| 12-204 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 12-205 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |
| 12-206 | OMe | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 12-207 | OMe | OMe | Et | CN | |
| 12-208 | OMe | NO ₂ | Et | CN | |
| 12-209 | OMe | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 12-210 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |
| 12-211 | SO ₂ Me | F | Et | CN | |
| 12-212 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 12-213 | SO ₂ Me | Br | Et | CN | |
| 12-214 | SO ₂ Me | I | Et | CN | |
| 12-215 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 12-216 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 12-217 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 12-218 | SO ₂ Me | OMe | Et | CN | |
| 12-219 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 12-220 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 12-221 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-222 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0300]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|----|----|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 12-223 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

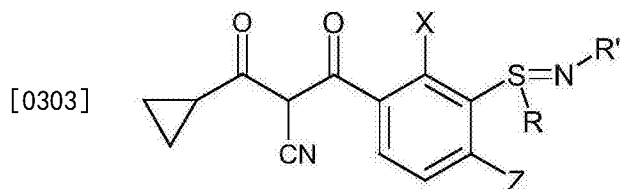
| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 12-224 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-225 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-226 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-227 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-228 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-229 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-230 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-231 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-232 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-233 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-234 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-235 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-236 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-237 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-238 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-239 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-240 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-241 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-242 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-243 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-244 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-245 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-246 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-247 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-248 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-249 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-250 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-251 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-252 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-253 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-254 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-255 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-256 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-257 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-258 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-259 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0301]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 12-260 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 12-261 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-262 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-263 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 12-264 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0302] 表13:本发明式(I)的化合物,其中Q为Q5,W为氢,t=0,且其他基团具有表中指出的含义。



[0304]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|-----|--------------------|----|----|---------------------------|
| 13-1 | Me | Me | Me | H | |
| 13-2 | Me | F | Me | H | |
| 13-3 | Me | Cl | Me | H | |
| 13-4 | Me | Br | Me | H | |
| 13-5 | Me | I | Me | H | |
| 13-6 | Me | CF ₃ | Me | H | |
| 13-7 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 13-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 13-9 | Me | OMe | Me | H | |
| 13-10 | Me | NO ₂ | Me | H | |
| 13-11 | Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 13-12 | Cl | Me | Me | H | |
| 13-13 | Cl | F | Me | H | |
| 13-14 | Cl | Cl | Me | H | |
| 13-15 | Cl | Br | Me | H | |
| 13-16 | Cl | I | Me | H | |
| 13-17 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 13-18 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 13-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 13-20 | Cl | OMe | Me | H | |
| 13-21 | Cl | NO ₂ | Me | H | |
| 13-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | H | |
| 13-23 | OMe | Me | Me | H | |
| 13-24 | OMe | F | Me | H | |
| 13-25 | OMe | Cl | Me | H | |

[0305]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|----|---|--|
| 13-26 | OMe | Br | Me | H | |
| 13-27 | OMe | I | Me | H | |
| 13-28 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 13-29 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |
| 13-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 13-31 | OMe | OMe | Me | H | |
| 13-32 | OMe | NO ₂ | Me | H | |
| 13-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | H | |
| 13-34 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 13-35 | SO ₂ Me | F | Me | H | |
| 13-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 13-37 | SO ₂ Me | Br | Me | H | |
| 13-38 | SO ₂ Me | I | Me | H | |
| 13-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 13-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 13-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | H | |
| 13-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | H | |
| 13-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | H | |
| 13-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | H | |
| 13-45 | Me | Me | Et | H | |
| 13-46 | Me | F | Et | H | |
| 13-47 | Me | Cl | Et | H | |
| 13-48 | Me | Br | Et | H | |
| 13-49 | Me | I | Et | H | |
| 13-50 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 13-51 | Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 13-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 13-53 | Me | OMe | Et | H | |
| 13-54 | Me | NO ₂ | Et | H | |
| 13-55 | Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 13-56 | Cl | Me | Et | H | |
| 13-57 | Cl | F | Et | H | |
| 13-58 | Cl | Cl | Et | H | |
| 13-59 | Cl | Br | Et | H | |
| 13-60 | Cl | I | Et | H | |
| 13-61 | Cl | CF ₃ | Et | H | |
| 13-62 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |

[0306]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---|--|
| 13-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 13-64 | Cl | OMe | Et | H | |
| 13-65 | Cl | NO ₂ | Et | H | |
| 13-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | H | |
| 13-67 | OMe | Me | Et | H | |
| 13-68 | OMe | F | Et | H | |
| 13-69 | OMe | Cl | Et | H | |
| 13-70 | OMe | Br | Et | H | |
| 13-71 | OMe | I | Et | H | |
| 13-72 | OMe | CF ₃ | Et | H | |
| 13-73 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 13-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 13-75 | OMe | OMe | Et | H | |
| 13-76 | OMe | NO ₂ | Et | H | |
| 13-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | H | |
| 13-78 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 13-79 | SO ₂ Me | F | Et | H | |
| 13-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |
| 13-81 | SO ₂ Me | Br | Et | H | |
| 13-82 | SO ₂ Me | I | Et | H | |
| 13-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |
| 13-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 13-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | H | |
| 13-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | H | |
| 13-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | H | |
| 13-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | H | |
| 13-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |

[0307]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 13-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 13-133 | Me | Me | Me | CN | |
| 13-134 | Me | F | Me | CN | |
| 13-135 | Me | Cl | Me | CN | |
| 13-136 | Me | Br | Me | CN | |

[0308]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|----|----|--|
| 13-137 | Me | I | Me | CN | |
| 13-138 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 13-139 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 13-140 | Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 13-141 | Me | OMe | Me | CN | |
| 13-142 | Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 13-143 | Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 13-144 | Cl | Me | Me | CN | |
| 13-145 | Cl | F | Me | CN | |
| 13-146 | Cl | Cl | Me | CN | |
| 13-147 | Cl | Br | Me | CN | |
| 13-148 | Cl | I | Me | CN | |
| 13-149 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |
| 13-150 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 13-151 | Cl | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 13-152 | Cl | OMe | Me | CN | |
| 13-153 | Cl | NO ₂ | Me | CN | |
| 13-154 | Cl | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 13-155 | OMe | Me | Me | CN | |
| 13-156 | OMe | F | Me | CN | |
| 13-157 | OMe | Cl | Me | CN | |
| 13-158 | OMe | Br | Me | CN | |
| 13-159 | OMe | I | Me | CN | |
| 13-160 | OMe | CF ₃ | Me | CN | |
| 13-161 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 13-162 | OMe | CF ₂ Cl | Me | CN | |
| 13-163 | OMe | OMe | Me | CN | |
| 13-164 | OMe | NO ₂ | Me | CN | |
| 13-165 | OMe | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 13-166 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 13-167 | SO ₂ Me | F | Me | CN | |
| 13-168 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |
| 13-169 | SO ₂ Me | Br | Me | CN | |
| 13-170 | SO ₂ Me | I | Me | CN | |
| 13-171 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 13-172 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 13-173 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | CN | |

[0309]

| | | | | | |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|----|----|--|
| 13-174 | SO ₂ Me | OMe | Me | CN | |
| 13-175 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | CN | |
| 13-176 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | CN | |
| 13-177 | Me | Me | Et | CN | |
| 13-178 | Me | F | Et | CN | |
| 13-179 | Me | Cl | Et | CN | |
| 13-180 | Me | Br | Et | CN | |
| 13-181 | Me | I | Et | CN | |
| 13-182 | Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 13-183 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 13-184 | Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 13-185 | Me | OMe | Et | CN | |
| 13-186 | Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 13-187 | Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 13-188 | Cl | Me | Et | CN | |
| 13-189 | Cl | F | Et | CN | |
| 13-190 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 13-191 | Cl | Br | Et | CN | |
| 13-192 | Cl | I | Et | CN | |
| 13-193 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 13-194 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |
| 13-195 | Cl | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 13-196 | Cl | OMe | Et | CN | |
| 13-197 | Cl | NO ₂ | Et | CN | |
| 13-198 | Cl | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 13-199 | OMe | Me | Et | CN | |
| 13-200 | OMe | F | Et | CN | |
| 13-201 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 13-202 | OMe | Br | Et | CN | |
| 13-203 | OMe | I | Et | CN | |
| 13-204 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 13-205 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |
| 13-206 | OMe | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 13-207 | OMe | OMe | Et | CN | |
| 13-208 | OMe | NO ₂ | Et | CN | |
| 13-209 | OMe | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 13-210 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |

[0310]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
|----|---|---|---|----|---------------------------|

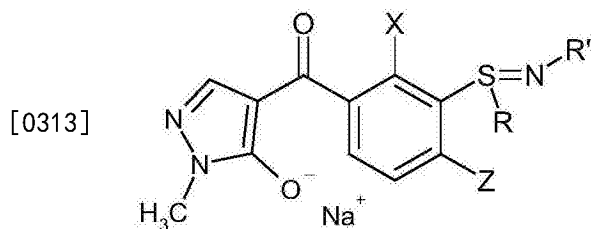
| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 13-211 | SO ₂ Me | F | Et | CN | |
| 13-212 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 13-213 | SO ₂ Me | Br | Et | CN | |
| 13-214 | SO ₂ Me | I | Et | CN | |
| 13-215 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 13-216 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 13-217 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | CN | |
| 13-218 | SO ₂ Me | OMe | Et | CN | |
| 13-219 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | CN | |
| 13-220 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | CN | |
| 13-221 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-222 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-223 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-224 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-225 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-226 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-227 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-228 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-229 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-230 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-231 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-232 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-233 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-234 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-235 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-236 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-237 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-238 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-239 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-240 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-241 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-242 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-243 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-244 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-245 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-246 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-247 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0311]

| | | | | | |
|----|---|---|---|----|---------------------------|
| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|----|---|---|---|----|---------------------------|

| | | | | | |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|----|--|
| 13-248 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-249 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-250 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-251 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-252 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-253 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-254 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-255 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-256 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-257 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-258 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-259 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-260 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-261 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-262 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-263 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 13-264 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0312] 表14: 本发明以钠盐形式存在的式(I)的化合物, 其中Q为Q3, Rⁱ为甲基, R^k和W各自为氢, t=0, 且其他基团具有表中指出的含义。



[0314]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|-----|------------------|----|----|---------------------------|
| 14-1 | Me | Me | Me | H | |
| 14-2 | Me | Cl | Me | H | |
| 14-3 | Me | CF ₃ | Me | H | |
| 14-4 | Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 14-5 | Cl | Me | Me | H | |
| 14-6 | Cl | Cl | Me | H | |
| 14-7 | Cl | CF ₃ | Me | H | |
| 14-8 | Cl | CHF ₂ | Me | H | |
| 14-9 | OMe | Me | Me | H | |
| 14-10 | OMe | Cl | Me | H | |
| 14-11 | OMe | CF ₃ | Me | H | |
| 14-12 | OMe | CHF ₂ | Me | H | |

[0315]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 14-13 | SO ₂ Me | Me | Me | H | |
| 14-14 | SO ₂ Me | Cl | Me | H | |
| 14-15 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | H | |
| 14-16 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | H | |
| 14-17 | Me | Me | Et | H | |
| 14-18 | Me | Cl | Et | H | |
| 14-19 | Me | CF ₃ | Et | H | |
| 14-20 | Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 14-21 | Cl | Me | Et | H | |
| 14-22 | Cl | Cl | Et | H | |
| 14-23 | Cl | CF ₃ | Et | H | |
| 14-24 | Cl | CHF ₂ | Et | H | |
| 14-25 | OMe | Me | Et | H | |
| 14-26 | OMe | Cl | Et | H | |
| 14-27 | OMe | CF ₃ | Et | H | |
| 14-28 | OMe | CHF ₂ | Et | H | |
| 14-29 | SO ₂ Me | Me | Et | H | |
| 14-30 | SO ₂ Me | Cl | Et | H | |
| 14-31 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | H | |
| 14-32 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | H | |
| 14-33 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-34 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-35 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-36 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-37 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-38 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-39 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-40 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-41 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-42 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-43 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-44 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-45 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-46 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-47 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-48 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | H | |
| 14-49 | Me | Me | Me | CN | |

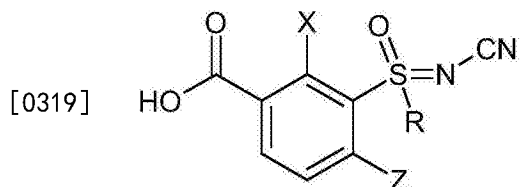
[0316]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 14-50 | Me | Cl | Me | CN | |
| 14-51 | Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 14-52 | Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 14-53 | Cl | Me | Me | CN | |
| 14-54 | Cl | Cl | Me | CN | |
| 14-55 | Cl | CF ₃ | Me | CN | |
| 14-56 | Cl | CHF ₂ | Me | CN | |
| 14-57 | OMe | Me | Me | CN | |
| 14-58 | OMe | Cl | Me | CN | |
| 14-59 | OMe | CF ₃ | Me | CN | |
| 14-60 | OMe | CHF ₂ | Me | CN | |
| 14-61 | SO ₂ Me | Me | Me | CN | |
| 14-62 | SO ₂ Me | Cl | Me | CN | |
| 14-63 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | CN | |
| 14-64 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | CN | |
| 14-65 | Me | Me | Et | CN | |
| 14-66 | Me | Cl | Et | CN | |
| 14-67 | Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 14-68 | Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 14-69 | Cl | Me | Et | CN | |
| 14-70 | Cl | Cl | Et | CN | |
| 14-71 | Cl | CF ₃ | Et | CN | |
| 14-72 | Cl | CHF ₂ | Et | CN | |
| 14-73 | OMe | Me | Et | CN | |
| 14-74 | OMe | Cl | Et | CN | |
| 14-75 | OMe | CF ₃ | Et | CN | |
| 14-76 | OMe | CHF ₂ | Et | CN | |
| 14-77 | SO ₂ Me | Me | Et | CN | |
| 14-78 | SO ₂ Me | Cl | Et | CN | |
| 14-79 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | CN | |
| 14-80 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | CN | |
| 14-81 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 14-82 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 14-83 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 14-84 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 14-85 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 14-86 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0317]

| 编号 | X | Z | R | R' | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|------------------|-------------------------------------|----|---------------------------|
| 14-87 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 14-88 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 14-89 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 14-90 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 14-91 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 14-92 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 14-93 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 14-94 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 14-95 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |
| 14-96 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | CN | |

[0318] 表15:本发明式(II)的化合物,其中Q*为羟基,R'为氰基,t为1,且其他基团具有表中指出的含义。



[0320]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|----|--------------------|----|---------------------------|
| 15-1 | Me | Me | Me | |
| 15-2 | Me | F | Me | |
| 15-3 | Me | Cl | Me | |
| 15-4 | Me | Br | Me | |
| 15-5 | Me | I | Me | |
| 15-6 | Me | CF ₃ | Me | |
| 15-7 | Me | CHF ₂ | Me | |
| 15-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | |
| 15-9 | Me | OMe | Me | |
| 15-10 | Me | NO ₂ | Me | |
| 15-11 | Me | SO ₂ Me | Me | |
| 15-12 | Cl | Me | Me | |
| 15-13 | Cl | F | Me | |
| 15-14 | Cl | Cl | Me | |
| 15-15 | Cl | Br | Me | |
| 15-16 | Cl | I | Me | |
| 15-17 | Cl | CF ₃ | Me | |
| 15-18 | Cl | CHF ₂ | Me | |
| 15-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | |

[0321]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|--|
| 15-20 | Cl | OMe | Me | |
| 15-21 | Cl | NO ₂ | Me | |
| 15-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | |
| 15-23 | OMe | Me | Me | |
| 15-24 | OMe | F | Me | |
| 15-25 | OMe | Cl | Me | |
| 15-26 | OMe | Br | Me | |
| 15-27 | OMe | I | Me | |
| 15-28 | OMe | CF ₃ | Me | (400 MHz, CDCl ₃ , δ, ppm) 8.34 (d,1H), 7.84 (d,1H), 4.16 (s,3H), 3.68 (s,3H) |
| 15-29 | OMe | CHF ₂ | Me | |
| 15-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | |
| 15-31 | OMe | OMe | Me | |
| 15-32 | OMe | NO ₂ | Me | |
| 15-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | |
| 15-34 | SO ₂ Me | Me | Me | |
| 15-35 | SO ₂ Me | F | Me | |
| 15-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | |
| 15-37 | SO ₂ Me | Br | Me | |
| 15-38 | SO ₂ Me | I | Me | |
| 15-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | |
| 15-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | |
| 15-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | |
| 15-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | |
| 15-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | |
| 15-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | |
| 15-45 | Me | Me | Et | |
| 15-46 | Me | F | Et | |
| 15-47 | Me | Cl | Et | |
| 15-48 | Me | Br | Et | |
| 15-49 | Me | I | Et | |
| 15-50 | Me | CF ₃ | Et | |
| 15-51 | Me | CHF ₂ | Et | |
| 15-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | |
| 15-53 | Me | OMe | Et | |
| 15-54 | Me | NO ₂ | Et | |
| 15-55 | Me | SO ₂ Me | Et | |

[0322]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---------------------------|
| 15-56 | Cl | Me | Et | |
| 15-57 | Cl | F | Et | |
| 15-58 | Cl | Cl | Et | |
| 15-59 | Cl | Br | Et | |
| 15-60 | Cl | I | Et | |
| 15-61 | Cl | CF ₃ | Et | |
| 15-62 | Cl | CHF ₂ | Et | |
| 15-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | |
| 15-64 | Cl | OMe | Et | |
| 15-65 | Cl | NO ₂ | Et | |
| 15-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | |
| 15-67 | OMe | Me | Et | |
| 15-68 | OMe | F | Et | |
| 15-69 | OMe | Cl | Et | |
| 15-70 | OMe | Br | Et | |
| 15-71 | OMe | I | Et | |
| 15-72 | OMe | CF ₃ | Et | |
| 15-73 | OMe | CHF ₂ | Et | |
| 15-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | |
| 15-75 | OMe | OMe | Et | |
| 15-76 | OMe | NO ₂ | Et | |
| 15-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | |
| 15-78 | SO ₂ Me | Me | Et | |
| 15-79 | SO ₂ Me | F | Et | |
| 15-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | |
| 15-81 | SO ₂ Me | Br | Et | |
| 15-82 | SO ₂ Me | I | Et | |
| 15-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | |
| 15-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | |
| 15-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | |
| 15-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | |
| 15-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | |
| 15-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | |
| 15-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |

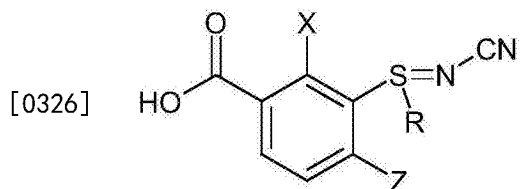
[0323]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---------------------------|
| 15-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |

[0324]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---------------------------|
| 15-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 15-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |

[0325] 表16:本发明式(II)的化合物,其中Q*为羟基,R'为氰基,t为0,且其他基团具有表中指出的含义。



[0327]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|-----|--------------------|----|---------------------------|
| 16-1 | Me | Me | Me | |
| 16-2 | Me | F | Me | |
| 16-3 | Me | Cl | Me | |
| 16-4 | Me | Br | Me | |
| 16-5 | Me | I | Me | |
| 16-6 | Me | CF ₃ | Me | |
| 16-7 | Me | CHF ₂ | Me | |
| 16-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | |
| 16-9 | Me | OMe | Me | |
| 16-10 | Me | NO ₂ | Me | |
| 16-11 | Me | SO ₂ Me | Me | |
| 16-12 | Cl | Me | Me | |
| 16-13 | Cl | F | Me | |
| 16-14 | Cl | Cl | Me | |
| 16-15 | Cl | Br | Me | |
| 16-16 | Cl | I | Me | |
| 16-17 | Cl | CF ₃ | Me | |
| 16-18 | Cl | CHF ₂ | Me | |
| 16-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | |
| 16-20 | Cl | OMe | Me | |
| 16-21 | Cl | NO ₂ | Me | |
| 16-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | |
| 16-23 | OMe | Me | Me | |
| 16-24 | OMe | F | Me | |
| 16-25 | OMe | Cl | Me | |
| 16-26 | OMe | Br | Me | |

[0328]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|---------------------------|
| 16-27 | OMe | I | Me | |
| 16-28 | OMe | CF ₃ | Me | |
| 16-29 | OMe | CHF ₂ | Me | |
| 16-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | |
| 16-31 | OMe | OMe | Me | |
| 16-32 | OMe | NO ₂ | Me | |
| 16-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | |
| 16-34 | SO ₂ Me | Me | Me | |
| 16-35 | SO ₂ Me | F | Me | |
| 16-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | |
| 16-37 | SO ₂ Me | Br | Me | |
| 16-38 | SO ₂ Me | I | Me | |
| 16-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | |
| 16-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | |
| 16-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | |
| 16-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | |
| 16-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | |
| 16-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | |
| 16-45 | Me | Me | Et | |
| 16-46 | Me | F | Et | |
| 16-47 | Me | Cl | Et | |
| 16-48 | Me | Br | Et | |
| 16-49 | Me | I | Et | |
| 16-50 | Me | CF ₃ | Et | |
| 16-51 | Me | CHF ₂ | Et | |
| 16-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | |
| 16-53 | Me | OMe | Et | |
| 16-54 | Me | NO ₂ | Et | |
| 16-55 | Me | SO ₂ Me | Et | |
| 16-56 | Cl | Me | Et | |
| 16-57 | Cl | F | Et | |
| 16-58 | Cl | Cl | Et | |
| 16-59 | Cl | Br | Et | |
| 16-60 | Cl | I | Et | |
| 16-61 | Cl | CF ₃ | Et | |
| 16-62 | Cl | CHF ₂ | Et | |
| 16-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | |

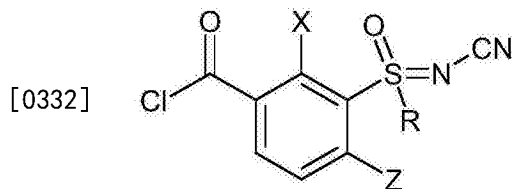
[0329]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---------------------------|
| 16-64 | Cl | OMe | Et | |
| 16-65 | Cl | NO ₂ | Et | |
| 16-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | |
| 16-67 | OMe | Me | Et | |
| 16-68 | OMe | F | Et | |
| 16-69 | OMe | Cl | Et | |
| 16-70 | OMe | Br | Et | |
| 16-71 | OMe | I | Et | |
| 16-72 | OMe | CF ₃ | Et | |
| 16-73 | OMe | CHF ₂ | Et | |
| 16-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | |
| 16-75 | OMe | OMe | Et | |
| 16-76 | OMe | NO ₂ | Et | |
| 16-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | |
| 16-78 | SO ₂ Me | Me | Et | |
| 16-79 | SO ₂ Me | F | Et | |
| 16-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | |
| 16-81 | SO ₂ Me | Br | Et | |
| 16-82 | SO ₂ Me | I | Et | |
| 16-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | |
| 16-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | |
| 16-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | |
| 16-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | |
| 16-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | |
| 16-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | |
| 16-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |

[0330]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---------------------------|
| 16-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 16-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |

[0331] 表17:本发明式(I)的化合物,其中Q*为氯,R'为氰基,t为1,且其他基团具有表中指出的含义。



[0333]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|-----|--------------------|----|---------------------------|
| 17-1 | Me | Me | Me | |
| 17-2 | Me | F | Me | |
| 17-3 | Me | Cl | Me | |
| 17-4 | Me | Br | Me | |
| 17-5 | Me | I | Me | |
| 17-6 | Me | CF ₃ | Me | |
| 17-7 | Me | CHF ₂ | Me | |
| 17-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | |
| 17-9 | Me | OMe | Me | |
| 17-10 | Me | NO ₂ | Me | |
| 17-11 | Me | SO ₂ Me | Me | |
| 17-12 | Cl | Me | Me | |
| 17-13 | Cl | F | Me | |
| 17-14 | Cl | Cl | Me | |
| 17-15 | Cl | Br | Me | |
| 17-16 | Cl | I | Me | |
| 17-17 | Cl | CF ₃ | Me | |
| 17-18 | Cl | CHF ₂ | Me | |
| 17-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | |
| 17-20 | Cl | OMe | Me | |
| 17-21 | Cl | NO ₂ | Me | |
| 17-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | |
| 17-23 | OMe | Me | Me | |
| 17-24 | OMe | F | Me | |
| 17-25 | OMe | Cl | Me | |
| 17-26 | OMe | Br | Me | |
| 17-27 | OMe | I | Me | |
| 17-28 | OMe | CF ₃ | Me | |
| 17-29 | OMe | CHF ₂ | Me | |
| 17-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | |
| 17-31 | OMe | OMe | Me | |
| 17-32 | OMe | NO ₂ | Me | |
| 17-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | |

[0334]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|---------------------------|
| 17-34 | SO ₂ Me | Me | Me | |
| 17-35 | SO ₂ Me | F | Me | |
| 17-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | |
| 17-37 | SO ₂ Me | Br | Me | |
| 17-38 | SO ₂ Me | I | Me | |
| 17-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | |
| 17-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | |
| 17-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | |
| 17-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | |
| 17-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | |
| 17-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | |
| 17-45 | Me | Me | Et | |
| 17-46 | Me | F | Et | |
| 17-47 | Me | Cl | Et | |
| 17-48 | Me | Br | Et | |
| 17-49 | Me | I | Et | |
| 17-50 | Me | CF ₃ | Et | |
| 17-51 | Me | CHF ₂ | Et | |
| 17-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | |
| 17-53 | Me | OMe | Et | |
| 17-54 | Me | NO ₂ | Et | |
| 17-55 | Me | SO ₂ Me | Et | |
| 17-56 | Cl | Me | Et | |
| 17-57 | Cl | F | Et | |
| 17-58 | Cl | Cl | Et | |
| 17-59 | Cl | Br | Et | |
| 17-60 | Cl | I | Et | |
| 17-61 | Cl | CF ₃ | Et | |
| 17-62 | Cl | CHF ₂ | Et | |
| 17-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | |
| 17-64 | Cl | OMe | Et | |
| 17-65 | Cl | NO ₂ | Et | |
| 17-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | |
| 17-67 | OMe | Me | Et | |
| 17-68 | OMe | F | Et | |
| 17-69 | OMe | Cl | Et | |
| 17-70 | OMe | Br | Et | |

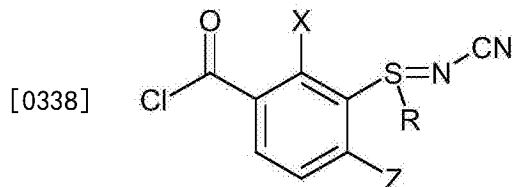
[0335]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---------------------------|
| 17-71 | OMe | I | Et | |
| 17-72 | OMe | CF ₃ | Et | |
| 17-73 | OMe | CHF ₂ | Et | |
| 17-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | |
| 17-75 | OMe | OMe | Et | |
| 17-76 | OMe | NO ₂ | Et | |
| 17-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | |
| 17-78 | SO ₂ Me | Me | Et | |
| 17-79 | SO ₂ Me | F | Et | |
| 17-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | |
| 17-81 | SO ₂ Me | Br | Et | |
| 17-82 | SO ₂ Me | I | Et | |
| 17-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | |
| 17-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | |
| 17-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | |
| 17-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | |
| 17-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | |
| 17-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | |
| 17-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |

[0336]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---------------------------|
| 17-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 17-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |

[0337] 表18:本发明式(II)的化合物,其中Q*为氯,R'为氰基,t为0,且其他基团具有表中指出的含义。



[0339]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|------|----|----|----|---------------------------|
| 18-1 | Me | Me | Me | |
| 18-2 | Me | F | Me | |
| 18-3 | Me | Cl | Me | |
| 18-4 | Me | Br | Me | |

[0340]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|---------------------------|
| 18-5 | Me | I | Me | |
| 18-6 | Me | CF ₃ | Me | |
| 18-7 | Me | CHF ₂ | Me | |
| 18-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | |
| 18-9 | Me | OMe | Me | |
| 18-10 | Me | NO ₂ | Me | |
| 18-11 | Me | SO ₂ Me | Me | |
| 18-12 | Cl | Me | Me | |
| 18-13 | Cl | F | Me | |
| 18-14 | Cl | Cl | Me | |
| 18-15 | Cl | Br | Me | |
| 18-16 | Cl | I | Me | |
| 18-17 | Cl | CF ₃ | Me | |
| 18-18 | Cl | CHF ₂ | Me | |
| 18-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | |
| 18-20 | Cl | OMe | Me | |
| 18-21 | Cl | NO ₂ | Me | |
| 18-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | |
| 18-23 | OMe | Me | Me | |
| 18-24 | OMe | F | Me | |
| 18-25 | OMe | Cl | Me | |
| 18-26 | OMe | Br | Me | |
| 18-27 | OMe | I | Me | |
| 18-28 | OMe | CF ₃ | Me | |
| 18-29 | OMe | CHF ₂ | Me | |
| 18-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | |
| 18-31 | OMe | OMe | Me | |
| 18-32 | OMe | NO ₂ | Me | |
| 18-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | |
| 18-34 | SO ₂ Me | Me | Me | |
| 18-35 | SO ₂ Me | F | Me | |
| 18-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | |
| 18-37 | SO ₂ Me | Br | Me | |
| 18-38 | SO ₂ Me | I | Me | |
| 18-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | |
| 18-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | |
| 18-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | |

[0341]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|---------------------------|
| 18-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | |
| 18-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | |
| 18-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | |
| 18-45 | Me | Me | Et | |
| 18-46 | Me | F | Et | |
| 18-47 | Me | Cl | Et | |
| 18-48 | Me | Br | Et | |
| 18-49 | Me | I | Et | |
| 18-50 | Me | CF ₃ | Et | |
| 18-51 | Me | CHF ₂ | Et | |
| 18-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | |
| 18-53 | Me | OMe | Et | |
| 18-54 | Me | NO ₂ | Et | |
| 18-55 | Me | SO ₂ Me | Et | |
| 18-56 | Cl | Me | Et | |
| 18-57 | Cl | F | Et | |
| 18-58 | Cl | Cl | Et | |
| 18-59 | Cl | Br | Et | |
| 18-60 | Cl | I | Et | |
| 18-61 | Cl | CF ₃ | Et | |
| 18-62 | Cl | CHF ₂ | Et | |
| 18-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | |
| 18-64 | Cl | OMe | Et | |
| 18-65 | Cl | NO ₂ | Et | |
| 18-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | |
| 18-67 | OMe | Me | Et | |
| 18-68 | OMe | F | Et | |
| 18-69 | OMe | Cl | Et | |
| 18-70 | OMe | Br | Et | |
| 18-71 | OMe | I | Et | |
| 18-72 | OMe | CF ₃ | Et | |
| 18-73 | OMe | CHF ₂ | Et | |
| 18-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | |
| 18-75 | OMe | OMe | Et | |
| 18-76 | OMe | NO ₂ | Et | |
| 18-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | |
| 18-78 | SO ₂ Me | Me | Et | |

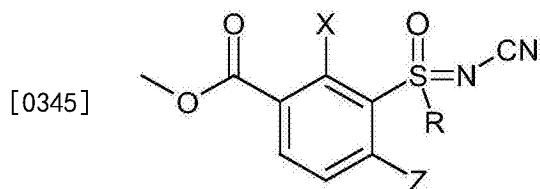
[0342]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---------------------------|
| 18-79 | SO ₂ Me | F | Et | |
| 18-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | |
| 18-81 | SO ₂ Me | Br | Et | |
| 18-82 | SO ₂ Me | I | Et | |
| 18-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | |
| 18-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | |
| 18-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | |
| 18-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | |
| 18-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | |
| 18-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | |
| 18-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |

[0343]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---------------------------|
| 18-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 18-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |

[0344] 表19:本发明式(II)的化合物,其中Q*为甲氧基,R'为氰基,t为1,且其他基团具有表中指出的含义。



[0346]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|----|--------------------|----|---------------------------|
| 19-1 | Me | Me | Me | |
| 19-2 | Me | F | Me | |
| 19-3 | Me | Cl | Me | |
| 19-4 | Me | Br | Me | |
| 19-5 | Me | I | Me | |
| 19-6 | Me | CF ₃ | Me | |
| 19-7 | Me | CHF ₂ | Me | |
| 19-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | |
| 19-9 | Me | OMe | Me | |
| 19-10 | Me | NO ₂ | Me | |
| 19-11 | Me | SO ₂ Me | Me | |
| 19-12 | Cl | Me | Me | |

[0347]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|---------------------------|
| 19-13 | Cl | F | Me | |
| 19-14 | Cl | Cl | Me | |
| 19-15 | Cl | Br | Me | |
| 19-16 | Cl | I | Me | |
| 19-17 | Cl | CF ₃ | Me | |
| 19-18 | Cl | CHF ₂ | Me | |
| 19-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | |
| 19-20 | Cl | OMe | Me | |
| 19-21 | Cl | NO ₂ | Me | |
| 19-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | |
| 19-23 | OMe | Me | Me | |
| 19-24 | OMe | F | Me | |
| 19-25 | OMe | Cl | Me | |
| 19-26 | OMe | Br | Me | |
| 19-27 | OMe | I | Me | |
| 19-28 | OMe | CF ₃ | Me | |
| 19-29 | OMe | CHF ₂ | Me | |
| 19-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | |
| 19-31 | OMe | OMe | Me | |
| 19-32 | OMe | NO ₂ | Me | |
| 19-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | |
| 19-34 | SO ₂ Me | Me | Me | |
| 19-35 | SO ₂ Me | F | Me | |
| 19-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | |
| 19-37 | SO ₂ Me | Br | Me | |
| 19-38 | SO ₂ Me | I | Me | |
| 19-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | |
| 19-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | |
| 19-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | |
| 19-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | |
| 19-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | |
| 19-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | |
| 19-45 | Me | Me | Et | |
| 19-46 | Me | F | Et | |
| 19-47 | Me | Cl | Et | |
| 19-48 | Me | Br | Et | |
| 19-49 | Me | I | Et | |

[0348]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|---------------------------|
| 19-50 | Me | CF ₃ | Et | |
| 19-51 | Me | CHF ₂ | Et | |
| 19-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | |
| 19-53 | Me | OMe | Et | |
| 19-54 | Me | NO ₂ | Et | |
| 19-55 | Me | SO ₂ Me | Et | |
| 19-56 | Cl | Me | Et | |
| 19-57 | Cl | F | Et | |
| 19-58 | Cl | Cl | Et | |
| 19-59 | Cl | Br | Et | |
| 19-60 | Cl | I | Et | |
| 19-61 | Cl | CF ₃ | Et | |
| 19-62 | Cl | CHF ₂ | Et | |
| 19-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | |
| 19-64 | Cl | OMe | Et | |
| 19-65 | Cl | NO ₂ | Et | |
| 19-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | |
| 19-67 | OMe | Me | Et | |
| 19-68 | OMe | F | Et | |
| 19-69 | OMe | Cl | Et | |
| 19-70 | OMe | Br | Et | |
| 19-71 | OMe | I | Et | |
| 19-72 | OMe | CF ₃ | Et | |
| 19-73 | OMe | CHF ₂ | Et | |
| 19-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | |
| 19-75 | OMe | OMe | Et | |
| 19-76 | OMe | NO ₂ | Et | |
| 19-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | |
| 19-78 | SO ₂ Me | Me | Et | |
| 19-79 | SO ₂ Me | F | Et | |
| 19-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | |
| 19-81 | SO ₂ Me | Br | Et | |
| 19-82 | SO ₂ Me | I | Et | |
| 19-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | |
| 19-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | |
| 19-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | |
| 19-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | |

[0349]

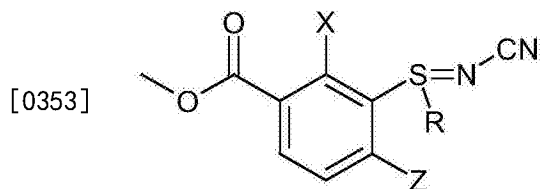
| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---------------------------|
| 19-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | |
| 19-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | |
| 19-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |

[0350]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---------------------------|
| 19-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 19-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |

[0351] 表20:本发明式(II)的化合物,其中Q*为甲氧基,R'为氰基,t为0,

[0352] 且其他基团具有表中指出的含义。



[0354]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|----|--------------------|----|---|
| 20-1 | Me | Me | Me | |
| 20-2 | Me | F | Me | |
| 20-3 | Me | Cl | Me | |
| 20-4 | Me | Br | Me | |
| 20-5 | Me | I | Me | |
| 20-6 | Me | CF ₃ | Me | (400 MHz, CDCl ₃ , δ, ppm) 8.01 (d,1H), 7.75 (d,1H), 3.98 (s,3H), 3.18 (s,3H), 3.08 (s,3H) |
| 20-7 | Me | CHF ₂ | Me | |
| 20-8 | Me | CF ₂ Cl | Me | |
| 20-9 | Me | OMe | Me | |
| 20-10 | Me | NO ₂ | Me | |
| 20-11 | Me | SO ₂ Me | Me | |
| 20-12 | Cl | Me | Me | |
| 20-13 | Cl | F | Me | |
| 20-14 | Cl | Cl | Me | |
| 20-15 | Cl | Br | Me | |
| 20-16 | Cl | I | Me | |
| 20-17 | Cl | CF ₃ | Me | |
| 20-18 | Cl | CHF ₂ | Me | |

[0355]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|----|---------------------------|
| 20-19 | Cl | CF ₂ Cl | Me | |
| 20-20 | Cl | OMe | Me | |
| 20-21 | Cl | NO ₂ | Me | |
| 20-22 | Cl | SO ₂ Me | Me | |
| 20-23 | OMe | Me | Me | |
| 20-24 | OMe | F | Me | |
| 20-25 | OMe | Cl | Me | |
| 20-26 | OMe | Br | Me | |
| 20-27 | OMe | I | Me | |
| 20-28 | OMe | CF ₃ | Me | |
| 20-29 | OMe | CHF ₂ | Me | |
| 20-30 | OMe | CF ₂ Cl | Me | |
| 20-31 | OMe | OMe | Me | |
| 20-32 | OMe | NO ₂ | Me | |
| 20-33 | OMe | SO ₂ Me | Me | |
| 20-34 | SO ₂ Me | Me | Me | |
| 20-35 | SO ₂ Me | F | Me | |
| 20-36 | SO ₂ Me | Cl | Me | |
| 20-37 | SO ₂ Me | Br | Me | |
| 20-38 | SO ₂ Me | I | Me | |
| 20-39 | SO ₂ Me | CF ₃ | Me | |
| 20-40 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Me | |
| 20-41 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Me | |
| 20-42 | SO ₂ Me | OMe | Me | |
| 20-43 | SO ₂ Me | NO ₂ | Me | |
| 20-44 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Me | |
| 20-45 | Me | Me | Et | |
| 20-46 | Me | F | Et | |
| 20-47 | Me | Cl | Et | |
| 20-48 | Me | Br | Et | |
| 20-49 | Me | I | Et | |
| 20-50 | Me | CF ₃ | Et | |
| 20-51 | Me | CHF ₂ | Et | |
| 20-52 | Me | CF ₂ Cl | Et | |
| 20-53 | Me | OMe | Et | |
| 20-54 | Me | NO ₂ | Et | |
| 20-55 | Me | SO ₂ Me | Et | |

[0356]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|-------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---------------------------|
| 20-56 | Cl | Me | Et | |
| 20-57 | Cl | F | Et | |
| 20-58 | Cl | Cl | Et | |
| 20-59 | Cl | Br | Et | |
| 20-60 | Cl | I | Et | |
| 20-61 | Cl | CF ₃ | Et | |
| 20-62 | Cl | CHF ₂ | Et | |
| 20-63 | Cl | CF ₂ Cl | Et | |
| 20-64 | Cl | OMe | Et | |
| 20-65 | Cl | NO ₂ | Et | |
| 20-66 | Cl | SO ₂ Me | Et | |
| 20-67 | OMe | Me | Et | |
| 20-68 | OMe | F | Et | |
| 20-69 | OMe | Cl | Et | |
| 20-70 | OMe | Br | Et | |
| 20-71 | OMe | I | Et | |
| 20-72 | OMe | CF ₃ | Et | |
| 20-73 | OMe | CHF ₂ | Et | |
| 20-74 | OMe | CF ₂ Cl | Et | |
| 20-75 | OMe | OMe | Et | |
| 20-76 | OMe | NO ₂ | Et | |
| 20-77 | OMe | SO ₂ Me | Et | |
| 20-78 | SO ₂ Me | Me | Et | |
| 20-79 | SO ₂ Me | F | Et | |
| 20-80 | SO ₂ Me | Cl | Et | |
| 20-81 | SO ₂ Me | Br | Et | |
| 20-82 | SO ₂ Me | I | Et | |
| 20-83 | SO ₂ Me | CF ₃ | Et | |
| 20-84 | SO ₂ Me | CHF ₂ | Et | |
| 20-85 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | Et | |
| 20-86 | SO ₂ Me | OMe | Et | |
| 20-87 | SO ₂ Me | NO ₂ | Et | |
| 20-88 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | Et | |
| 20-89 | Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-90 | Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-91 | Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-92 | Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |

[0357]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---------------------------|
| 20-93 | Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-94 | Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-95 | Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-96 | Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-97 | Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-98 | Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-99 | Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-100 | Cl | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-101 | Cl | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-102 | Cl | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-103 | Cl | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-104 | Cl | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-105 | Cl | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-106 | Cl | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-107 | Cl | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-108 | Cl | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-109 | Cl | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-110 | Cl | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-111 | OMe | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-112 | OMe | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-113 | OMe | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-114 | OMe | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-115 | OMe | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-116 | OMe | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-117 | OMe | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-118 | OMe | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-119 | OMe | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-120 | OMe | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-121 | OMe | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-122 | SO ₂ Me | Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-123 | SO ₂ Me | F | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-124 | SO ₂ Me | Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-125 | SO ₂ Me | Br | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-126 | SO ₂ Me | I | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-127 | SO ₂ Me | CF ₃ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-128 | SO ₂ Me | CHF ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-129 | SO ₂ Me | CF ₂ Cl | CH ₂ CH ₂ OMe | |

[0358]

| 编号 | X | Z | R | 物理数据(¹ H NMR) |
|--------|--------------------|--------------------|-------------------------------------|---------------------------|
| 20-130 | SO ₂ Me | OMe | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-131 | SO ₂ Me | NO ₂ | CH ₂ CH ₂ OMe | |
| 20-132 | SO ₂ Me | SO ₂ Me | CH ₂ CH ₂ OMe | |

[0359] B. 制剂实施例

[0360] a)通过如下方法获得粉剂:将10重量份式(I)化合物和/或其盐和90重量份作为惰性物质的滑石进行混合并在锤式粉碎机中粉碎混合物。

[0361] b)通过如下方法获得易于分散于水中的可湿性粉剂:将25重量份式(I)化合物和/或其盐、64重量份作为惰性物质的含高岭土的石英、10重量份木质素磺酸钾,和1重量份的作为润湿剂和分散剂的油酰基甲基牛磺酸钠混合,并在销棒式磨机中研磨所述混合物。

[0362] c)通过如下方法获得易于分散于水的分散浓缩剂:将20重量份式(I)的化合物和/或其盐与6重量份烷基酚聚乙二醇醚(**®Triton** X 207)、3重量份异十三烷醇聚乙二醇醚(8E0)和71重量份石蜡矿物油(沸程为例如约255至高于277℃)混合,并在球磨机中研磨所述混合物至细度低于5微米。

[0363] d)乳油由15重量份式(I)的化合物和/或其盐、75重量份作为溶剂的环己酮和10重量份作为乳化剂的乙氧基化壬基酚而获得。

[0364] e)通过如下方法获得水分散性颗粒剂:

[0365] 将以下物质混合

[0366] 75重量份式(I)的化合物和/或其盐,

[0367] 10重量份木质素磺酸钙,

[0368] 5重量份月桂基硫酸钠,

[0369] 3重量份聚乙烯醇,和

[0370] 7重量份高岭土,

[0371] 将混合物在销棒式磨机中研磨并在流化床中通过向混合物表面喷洒作为粒化液体的水而使粉末粒化。

[0372] f)通过如下方法获得水分散性颗粒剂:

[0373] 将以下物质在胶磨机中均化和预粉碎

[0374] 25重量份式(I)的化合物和/或其盐,

[0375] 5重量份2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸钠,

[0376] 2重量份油酰基甲基牛磺酸钠,

[0377] 1重量份聚乙烯醇,

[0378] 17重量份碳酸钙,和

[0379] 50重量份水,

[0380] 随后在玻璃磨机中研磨所述混合物,并在喷雾塔中通过单物质喷嘴雾化和干燥所得悬浮剂。

[0381] C. 生物实施例

[0382] 1. 抵抗有害植物的出苗前除草作用

[0383] 将单子叶或双子叶杂草或作物植物的种子置于盛有沙质壤土的木质纤维盆中,并

用土壤覆盖。将本发明的化合物配制为可湿性粉剂(WP)或乳油(EC)的形式,然后以水悬浮液或乳液的形式施用至覆盖土壤的表面,水施用率为600至800l/ha(经换算)且添加了0.2%的润湿剂。在处理后,将盆置于温室中并且保持在对于所测试的植物而言良好的生长条件下。在3周测试期后,通过与未处理的对照组比较,目测评估对测试植物的损害程度(除草活性百分比(%):100%活性=植物死亡、0%活性=与对照植物类似)。此处,例如化合物编号3-160和4-160在320g/ha的施用率下示出了各自对苘麻(*Abutilon theophrasti*)、反枝苋(*Amaranthus retroflexus*)具有至少80%的活性。化合物编号2-160和10a-160在320g/ha的施用率下示出了各自对野荞麦和繁缕具有至少80%的活性。

[0384] 2. 抗有害植物的出苗后除草作用

[0385] 将单子叶或双子叶杂草或作物植物的种子置于盛有沙质壤土的木质纤维盆中,用土壤覆盖并置于温室中,在良好生长条件下栽培。在播种两到三周后,对生长至一叶期的测试植物进行处理。将本发明化合物配制为可湿性粉剂(WP)或乳油(EC),然后以水悬浮液或乳液的形式喷洒至绿色植物部位,水施用率为600至800l/ha(经换算)且添加了0.2%的润湿剂。将测试植物在温室中于最佳生长条件下放置约3周后,通过与未处理的对照组比较,目测评估制剂的活性(除草活性百分比(%):100%活性=植物死亡、0%活性=与对照植物类似)。此处,例如化合物编号2-160、3-160、4-160和10a-160在80g/ha的施用率下示出了各自对苘麻(*Abutilon theophrasti*)和稗草(*Echinochloa crus galli*)具有至少80%的活性。