(19)中华人民共和国国家知识产权局

(12)发明专利

(10)授权公告号 CN 1976586 B
(45)授权公告日 2014.06.25

(21)申请号 200580021850.9

(22)申请日 2005.05.12

(30)优先权数据
0412072.1 2004.05.28 GB

(85)PCT国际申请进入国家阶段日
2006.12.28

(86)PCT国际申请的申请数据
PCT/IB2005/001468 2005.05.12

(87)PCT国际申请的公布数据
WO2005/115146 EN 2005.12.08

(73)专利权人 辛根塔参与股份公司
地址 瑞士巴塞尔

(72)发明人 J·卡赛雷 L-P·莫雷莱斯
P·迈恩费什 F·策德鲍姆
C·科西 T·皮特纳

(74)专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商标事务所 11038
代理人 张敏

(51)Int.Cl.
A01N 43/60(2006.01)
A01N 47/30(2006.01)
A01N 47/20(2006.01)
C07D 401/00(2006.01)
C07D 295/00(2006.01)

(56)对比文件
WO 0242310 A2,2002.05.30, 说明书第150页化合物202.
US 3457263 A,1969.07.22, 说明书第5栏第6-10行.
EP 0103464 A2,1984.03.21, 说明书第21－28页.

审查员 康恩待

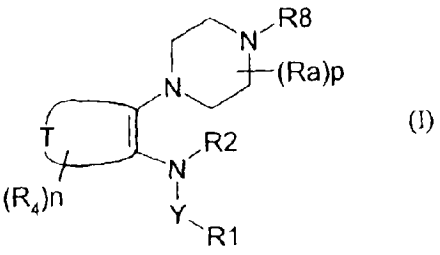
权利要求书2页 说明书67页

(54)发明名称

哌嗪衍生物及其在防治害虫中的用途

(57)摘要

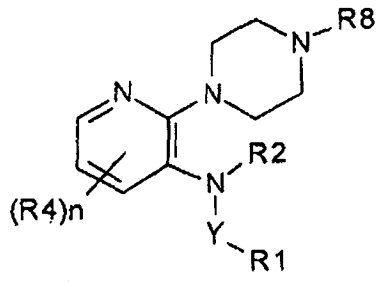
式(I)化合物或其盐或N-氧化物或含有它们的组合物用于防治昆虫、螨虫、软体动物和线虫的用途,其中Y是单键、C=O、C=S或$S(O)_m$,m是0、1或2;所述环是6元芳环或是5或6元杂芳环;Ra、R^1、R^2、R^4和R^8是特定的有机基团;n和p独立地是0-4。本发明还提供了新化合物。



(I)

CN 1976586 B

1. 式 I' 的化合物



(I')

其中

Y 是 C=O ;

R^1 是杂芳基,其中所述杂芳基是吡啶,其可以任选被卤素、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 卤代烷氧基取代 ;

R^2 是 H 或甲基 ;以及

R^4 各自独立地为卤素、C_{1-8} 烷基、C_{1-8} 卤代烷基、C_{1-8} 烷氧基、C_{1-6} 卤代烷氧基 ;

n 是 0、1、2 或 3 ;

R^8 是 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$,其中 z 是 1,$R^{51}$ 和 R^{52} 各自独立地是 H,R^{53} 和 R^{54} 各自独立地是 H,以及 R^{55} 是被卤素、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基取代的苯基 ;或其盐或 N- 氧化物。

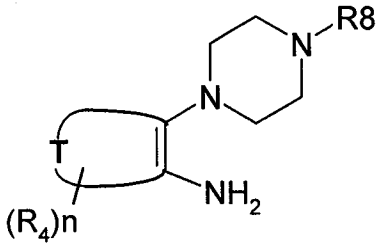
2. 根据权利要求 1 的化合物,其中 R^1 是卤素 - 取代的吡啶基。

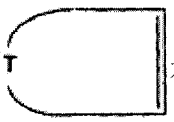
3. 根据权利要求 1 或权利要求 2 的化合物,其中 R^2 是氢。

4. 根据权利要求 1 或权利要求 2 的化合物,其中 R^4 各自独立地是氟、氯、溴、C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 卤代烷基。

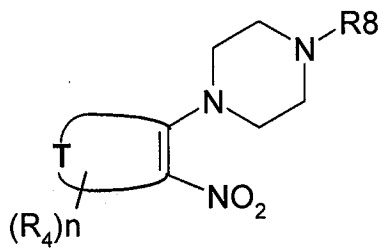
5. 根据权利要求 3 的化合物,其中 R^4 各自独立地是氟、氯、溴、C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 卤代烷基。

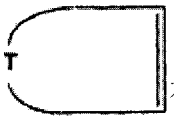
6. 下式的化合物



其中 R^4、R^8、和 n 如权利要求 1 中对式 I' 所定义,以及环  是吡啶。

7. 下式的化合物



其中 R^4、R^8 和 n 如权利要求 1 中对式 I' 所定义，以及环  是吡啶。

8. 一种杀昆虫组合物，含有杀昆虫有效量的如权利要求 1 所定义的式 I' 化合物。

9. 一种杀灭和防治昆虫的方法，其包括对害虫、害虫的栖息地或易受害虫侵害的植物施用杀昆虫有效量的权利要求 1 中所定义的式 I' 化合物。

哌嗪衍生物及其在防治害虫中的用途

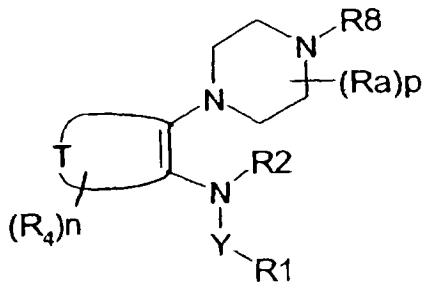
[0001] 本发明涉及哌嗪衍生物，制备它们的方法，包含它们的杀昆虫、杀螨虫、杀软体动物和杀线虫的组合物以及使用它们杀灭和防治昆虫、螨虫、软体动物和线虫的方法。

[0002] 例如在US3331845中公开了哌嗪衍生物具有抗原虫(antiprotazoal)特性以及在EP103464中公开了嘧啶基哌嗪化合物具有杀菌特性。WO02/42310公开了作为杀虫剂的7-氧杂二环[2.2.1]庚烷。在US3457263和WO2004/089905中描述了具有药用性质的哌嗪衍生物。哌嗪化合物的合成在J.Het.Chem.,38,2001,985-988中作了描述。

[0003] 现在令人惊奇地发现一些哌嗪具有杀昆虫特性。

[0004] 因此本发明提供了一种杀灭和防治昆虫、螨虫、线虫或软体动物的方法，其包括对害虫、害虫的栖息地或易受害虫侵害的植物施用杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物的有效量的式(I)化合物或其盐或N-氧化物：

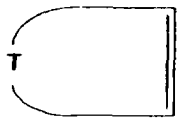
[0005]



(I)

[0006] Y是单键、C＝O、C＝S或$S(O)_m$，其中m是0、1或2；所述环

[0007]



[0008] 是6元芳环或是5或6元杂芳环；

[0009] R^1是氢、任选取代的烷基、任选取代的烷氧羰基、任选取代的烷基羰基、氨基羰基、任选取代的烷基氨基羰基、任选取代的二烷基氨基羰基、任选取代的芳基、任选取代的杂芳基、任选取代的烷氧基、任选取代的芳氧基、任选取代的杂芳氧基、任选取代的杂环氧基、氰基、任选取代的烯基、任选取代的炔基、任选取代的环烷基、任选取代的环烯基、甲酰基、任选取代的杂环基、任选取代的烷硫基、NO或$NR^{13}R^{14}$，其中R^{13}和R^{14}独立地是氢、COR^{15}、任选取代的烷基、任选取代的芳基、任选取代的杂芳基、任选取代的杂环基或R^{13}和R^{14}与它们所连接N原子一起形成$-N＝C(R^{16})-NR^{17}R^{18}$基团，或$R^{13}$和$R^{14}$与它们所相连的N原子一起形成五、六或七元杂环，其中所述杂环可含有一个或两个进一步选自O、N、或S的杂原子并且其可任选被一个或两个C_{1-6}烷基取代；R^{15}是H、任选取代的烷基、任选取代的烷氧基、任选取代的芳基、任选取代的芳氧基、任选取代的杂芳基、任选取代的杂芳氧基或$NR^{19}R^{20}$；R^{16}、R^{17}和R^{18}各自独立地是H或低级烷基；R^{19}和R^{20}独立地是任选取代的烷基、任选取代的芳基或者任选取代的杂芳基；

[0010] R^2是H、羟基、任选取代的烷氧基或者任选取代的烷基；或者R^1和R^2与基团Y和N

一起形成 5- 或 6- 元杂环，所述杂环可任选含有一个进一步选自 O、N 或 S 的杂原子并且其可任选被 C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 卤代烷基或卤素取代。

[0011] R^4 各自独立地为卤素、硝基、氰基、任选取代的 C_{1-8} 烷基、任选取代的 C_{2-6} 烯基、任选取代的 C_{2-6} 炔基、任选取代的烷氧羰基、任选取代的烷基羰基、任选取代的烷基氨基羰基、任选取代的二烷基氨基羰基、任选取代的 C_{3-7} 环烷基、任选取代的芳基、任选取代的杂芳基、任选取代的杂环基、任选取代的烷氧基、任选取代的芳氧基、任选取代的杂芳氧基、任选取代的烷硫基或 $R^{21}R^{22}N$，其中 R^{21} 和 R^{22} 独立地是氢、C_{1-8} 烷基、C_{3-7} 环烷基、C_{3-6} 烯基、C_{3-6} 炔基、C_{3-7} 环烷基 (C_{1-4}) 烷基、C_{2-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基、C_{1-6} 烷氧羰基或者 R^{21} 和 R^{22} 与它们所相连的 N 原子一起形成五、六或七元杂环，所述杂环可含有一个或两个进一步选自 O、N、或 S 的杂原子并且其可任选被一个或两个 C_{1-6} 烷基取代，或 2 个相邻基团 R^4 与它们所相连的碳原子一起形成 4、5、6 或 7 元碳环或杂环，所述碳环或杂环可任选被卤素取代；n 是 0、1、2、3 或 4。

[0012] R^8 是任选取代的烷基、任选取代的烯基、任选取代的炔基、任选取代的环烷基、任选取代的芳基、任选取代的烷氧基、任选取代的芳氧基、任选取代的烷氧羰基、任选取代的烷基羰基或任选取代的烯基 羰基；

[0013] Ra 各自独立地是卤素、羟基、氰基、任选取代的 C_{1-8} 烷基、任选取代的 C_{2-6} 烯基、任选取代的 C_{2-6} 炔基、任选取代的烷氧羰基、任选取代的烷基羰基、任选取代的烷基氨基羰基、任选取代的二烷基氨基羰基、任选取代的 C_{3-7} 环烷基、任选取代的芳基、任选取代的杂芳基、任选取代的杂环基、任选取代的烷氧基、任选取代的芳氧基、任选取代的杂芳氧基、任选取代的烷硫基、任选取代的芳硫基或 $R^{23}R^{24}N$，其中 R^{23} 和 R^{24} 独立地是氢、C_{1-8} 烷基、C_{3-7} 环烷基、C_{3-6} 烯基、C_{3-6} 炔基、C_{3-7} 环烷基 (C_{1-4}) 烷基、C_{2-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基、C_{1-6} 烷氧羰基或 R^{23} 和 R^{24} 和与它们所相连的 N 原子一起形成五、六或七元杂环，所述杂环可含有一或二个进一步选自 O、N 或 S 的杂原子并且其可任选被一个或两个 C_{1-6} 烷基取代，或与同一个碳原子相连的两个 Ra 基团是 = O、= S、= NRb、= CRcRd，其中 Rb、Rc 和 Rd 独立地是 H 或任选取代的烷基；p 是 0、1、2、3、或 4。

[0014] 式 (I) 化合物可以各种几何或光学异构体或互变异构形式存在。本发明涵盖了所有的这些异构体、互变异构体和它们以各种比例的混合物以及同位素的形式例如氘代的化合物。

[0015] 单独的烷基或作为大基团（例如烷氧基、烷氧羰基、烷基羰基、烷基氨基羰基、二烷基氨基羰基）的一部分的烷基可以各自是直链或支链的，例如是甲基、乙基、正丙基、正丁基、正戊基、正己基、异丙基；正丁基、仲丁基、异丁基、特丁基或者新戊基。合适的烷基是 C_1-C_{12} 烷基，但优选 C_1-C_{10}、更优选 C_1-C_8、甚至更优选 C_1-C_6 和最优选 C_1-C_4 的烷基。

[0016] 如果存在，烷基部分（单独或作为大基团例如烷氧基、烷氧羰基、烷基羰基、烷基氨基羰基、二烷基氨基羰基的一部分）上任选的取代基包括选自卤素、硝基、氰基、NCS-、C_{3-7} 环烷基（其任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、C_{5-7} 环烯基（其任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、羟基、C_{1-10} 烷氧基、(C_{1-10}) 烷氧基 (C_{1-10}) 烷氧基、三 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷 (C_{1-6}) 烷氧基、C_{1-6} 烷氧羰基 (C_{1-10}) 烷氧基、C_{1-10} 卤代烷氧基、芳基 (C_{1-4}) 烷氧基（其中芳基任选被取代）、C_{3-7} 环烷基氧基（其中环烷基任选被 C_{1-6} 烷基或卤素 取代）、C_{2-10} 烯氧基、C_{2-10} 炔氧基、SH、C_{1-10} 烷硫基、C_{1-10} 卤代烷硫基、芳基 (C_{1-4}) 烷硫基（其中芳基是任选被取代的）、C_{3-7} 环烷基硫基（其

中环烷基任选被C_{1-6}烷基或卤素取代）、三（C_{1-4}）烷基甲硅烷基（C_{1-6}）烷硫基、芳硫基（其中芳基是任选被取代的）、C_{1-6}烷基磺酰基、C_{1-6}卤代烷基磺酰基、C_{1-6}烷基亚磺酰基、C_{1-6}卤代烷基亚磺酰基、芳基磺酰基（其中芳基可以是任选被取代的）、三（C_{1-4}）烷基甲硅烷基、芳基二（C_{1-4}）烷基甲硅烷基、（C_{1-4}）烷基二芳基甲硅烷基、三芳基甲硅烷基、C_{1-10}烷基羰基、HO_2C、C_{1-10}烷氧羰基、氨基羰基、C_{1-6}烷基氨基羰基、二（C_{1-6} 烷基）氨基羰基、N-（C_{1-3}烷基）-N-（C_{1-3}烷氧基）氨基羰基、C_{1-6}烷基羰氧基、芳基羰氧基（其中芳基是任选被取代的）、二（C_{1-6}）烷基氨基羰基氧基、肟例如＝NO烷基、＝NO卤代烷基和＝NO芳基（其是任选被取代的）、芳基（其是任选被取代的）、杂芳基（其是任选被取代的）、杂环基（其是任选被C_{1-6}烷基或卤素取代的）、芳氧基（其中芳基是任选被取代的）、杂芳氧基（其中杂芳基是任选被取代的）、杂环氧基（其中杂环基任选被C_{1-6}烷基或卤素取代）、氨基、C_{1-6}烷基氨基、二（C_{1-6}）烷基氨基、C_{1-6}烷基羰基氨基、N-（C_{1-6}）烷基羰基 -N-（C_{1-6}）烷基氨基、C_{2-6} 烯基羰基、C_{2-6}炔基羰基、C_{3-6}烯氧基羰基、C_{3-6}炔氧基羰基、芳氧羰基（其中芳基任选被取代）和芳基羰基（其中芳基任选被取代）中的一种或多种。

[0017] 烯基和炔基部分可以是直链或支链形式，并且烯基部分可以适当地是（E）-或（Z）-构型。例如为乙烯基、烯丙基和炔丙基。

[0018] 如果存在，烯基或炔基上可带有任意取代基，这些取代基包括上面烷基部分所给出的那些任意取代基。

[0019] 在本说明书范围内酰基是任选取代的C_{1-6}烷基羰基（例如乙酰基）、任选取代的C_{2-6}烯基羰基、任选取代的C_{2-6}炔基羰基、任选取代的芳羰基（例如苯甲酰基）或任选取代的杂芳羰基。

[0020] 卤素是氟、氯、溴或碘。

[0021] 卤代烷基是被一个或多个相同或不同的卤素原子取代的烷基，例如CF_3、CF_2Cl、CF_3CH_2或CHF_2CH_2。

[0022] 在本申请说明书范围内术语“芳基”、“芳环”和“芳环系”是指可以是单-、双-或三环的环系。这类环的例子包括苯基、萘基、蒽基、茚基或菲啶基。芳基优选是苯基。另外，术语“杂芳基”、“杂芳环”或“杂芳环”或“杂芳环系”是指含有至少一个杂原子并且由具有单环或两个或多个稠环组成的芳环系。优选的是，单环可含至多三个和双环体系至多四个杂原子，所述杂原子优选选自氮、氧和硫。这类基团的例子包括呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、噁唑基、异噁唑基、噻唑基、异噻唑基、1,2,3-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑、1,2,5-噻二唑、吡啶基、嘧啶基、哒嗪基、吡嗪基、1,2,3-三嗪基、1,2,4-三嗪基、1,3,5-三嗪基、苯并呋喃基、苯并异呋喃基、苯并噻吩噻吩基、苯并异噻吩基、吲哚基、异氮茚基、吲唑基、苯并噻唑基、苯并异噻唑基、苯并噁唑基、苯并异噁唑基、苯并咪唑基、2,1,3-苯并噁二唑、喹啉基、异喹啉基、噌啉基、酞嗪基、喹唑啉基、喹喔啉基、萘啶基、苯并三嗪基、嘌呤基、蝶啶基和中氮茚基。优选的杂芳基的例子包括吡啶基、嘧啶基、三嗪基、噻吩基、呋喃基、噁唑基、异噁唑基、2,1,3-苯并噁二唑基和噻唑基。

[0023] 术语杂环和杂环基是指含有至多10个原子的包括一个或多个（优选一个或两个）选自O、S和N的杂原子的非芳族环。这类环的例子包括1,3-二氧戊烷、四氢呋喃和吗啉。

[0024] 如果存在，杂环基上可带有任意取代基，这些取代基包括C_{1-6}烷基和C_{1-6}卤代烷基

以及上面对烷基部分所给出的那些任意取代基。

[0025] 环烷基包括环丙基、环戊基和环己基。

[0026] 环烯基包括环戊烯基和环己烯基。

[0027] 如果存在，环烷基或环烯基上可带有任意取代基，这些取代基包括 C_{1-3} 烷基以及上面对烷基部分所给出的那些任意取代基。

[0028] 碳环包括芳基、环烷基和环烯基。如果存在，芳基或杂芳基上任选的取代基独立地选自卤素、硝基、氰基、NCS-、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷 基、C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基、C_{2-6} 烯基、C_{2-6} 卤代烯基、C_{2-6} 炔基、C_{3-7} 环烷基（其任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、C_{5-7} 环烯基（任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、羟基、C_{1-10} 烷氧基、C_{1-10} 烷氧基 (C_{1-10}) 烷氧基、三 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基 (C_{1-6}) 烷氧基、C_{1-6} 烷氧羰基 (C_{1-10}) 烷氧基、C_{1-10} 卤代烷氧基、芳基 (C_{1-4}) 烷氧基（其中芳基任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、C_{3-7} 环烷基氧基（其中环烷基任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、C_{2-10} 烯氧基、C_{2-10} 炔氧基、SH、C_{1-10} 烷硫基、C_{1-10} 卤代烷硫基、芳基 (C_{1-4}) 烷硫基、C_{3-7} 环烷基硫基（其中环烷基任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、三 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基 (C_{1-6}) 烷硫基、芳硫基、C_{1-6} 烷基磺酰基、C_{1-6} 卤代烷基磺酰基、C_{1-6} 烷基亚磺酰基、C_{1-6} 卤代烷基亚磺酰基、芳基磺酰基、三 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基、芳基二 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基、(C_{1-4}) 烷基二芳基甲硅烷基、三芳基甲硅烷基、C_{1-10} 烷基羰基、HO_2C、C_{1-10} 烷氧羰基、氨基羰基、C_{1-6} 烷基氨基羰基、二 (C_{1-6} 烷基）氨基羰基、N-(C_{1-3} 烷基）-N-(C_{1-3} 烷氧基）氨基羰基、C_{1-6} 烷基羰氧基、芳基羰氧基、二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基氧基、芳基（其任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、杂芳基（其任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、杂环基（其任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、芳氧基（其任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、杂芳氧基（其任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、杂环氧基（其中杂环基任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、氨基、C_{1-6} 烷基氨基、二 (C_{1-6}) 烷基氨基、C_{1-6} 烷基羰基氨基、N-(C_{1-6}) 烷基羰基 -N-(C_{1-6}) 烷基氨基、芳基羰基（其中芳基任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）或者芳基或杂芳基上两相邻位置可成环形成 5、6 或 7 元碳环或杂环，所述碳环或杂环任选被卤素或 C_{1-6} 烷基取代。更进一步的芳基或杂芳基的取代基包括芳基羰基氨基（其中芳基被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、(C_{1-6}) 烷氧羰基氨基 (C_{1-6}) 烷氧羰基 -N-(C_{1-6}) 烷基氨基、芳氧基羰基氨基（其中芳基被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、芳氧羰基 -N-(C_{1-6}) 烷基氨基（其中芳基被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、烷基磺酰氨基（其中芳基被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、芳基磺酰基 -N-(C_{1-6}) 烷基氨基（其中芳基被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、芳基 -N-(C_{1-6}) 烷基氨基（其中芳基被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、芳基氨基（其中芳基被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、杂芳基氨基（其中杂芳基被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、杂环 氨基（其中杂环基被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、氨基羰基氨基、C_{1-6} 烷基氨基羰基氨基、二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基氨基、芳基氨基羰基氨基（其中芳基被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、芳基 -N-(C_{1-6}) 烷基氨基羰基氨基（其中芳基被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）、C_{1-6} 烷基氨基羰基 -N-(C_{1-6}) 烷基氨基、二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基 -N-(C_{1-6}) 烷基氨基、芳基氨基羰基 -N-(C_{1-6}) 烷基氨基（其中芳基被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）和芳基 -N-(C_{1-6}) 烷基氨基羰基 -N-(C_{1-6}) 烷基氨基（其中芳基被 C_{1-6} 烷基或卤素取代）。

[0029] 对苯基部分、杂环基和杂芳基被取代的情况，优选所述取代基独立地选自卤素、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-6} 卤代烷氧基、C_{1-6} 烷硫基、C_{1-6} 卤代烷硫基、C_{1-6} 烷基亚磺酰基、C_{1-6} 卤代烷基亚磺酰基、C_{1-6} 烷基磺酰基、C_{1-6} 卤代烷基磺酰基、C_{2-6} 烯基、C_{2-6} 卤代烯基、C_{2-6} 炔基、C_{3-7} 环烷基、硝基、氰基、CO_2H、C_{1-6} 烷基羰基、C_{1-6}

烷氧羰基、$R^{25}R^{26}N$ 或 $R^{27}R^{28}NC(O)$ 中的一种或多种；其中 R^{25}、R^{26}、R^{27} 和 R^{28} 独立地是氢或 C_{1-6} 烷基。进一步优选的取代基是芳基和杂芳基。

[0030] 卤代烯基是其中被一个或多个相同或不同的卤素原子取代的烯基。

[0031] 应理解的是二烷基氨基取代基包括那些与它们所相连的 N 原子一起形成五、六或七元杂环的二烷基，其中所述杂环可含有一个或两个进一步选自 O、N 或 S 的杂原子并且它可任选被一个或两个独立地选自 (C_{1-6}) 烷基的取代基取代。如果杂环是通过 N 原子上的两个基团形成的，则所形成的环合适的是吡咯、哌啶、硫吗啉和吗啉，其中各自可被一个或两个独立地选自 (C_{1-6}) 烷基的基团取代。

[0032] 优选烷基部分上任选取代的取代基包括选自卤素、硝基、氰基、HO_2C、C_{1-10} 烷氧基（其任选被 C_{1-10} 烷氧基取代）、芳基 (C_{1-4}) 烷氧基、C_{1-10} 烷硫基、C_{1-10} 烷羰基、C_{1-10} 烷氧羰基、C_{1-6} 烷基氨基羰基、二 (C_{1-6} 烷基）氨基羰基、(C_{1-6}) 烷基羰基氧基、任选取代的苯基、杂芳基、芳氧基、芳基羰氧基、杂芳氧基、杂环基、杂环氧基、C_{3-7} 环烷基（其任选被 (C_{1-6}) 烷基或卤素取代）、C_{3-7} 环烷基氧基、C_{5-7} 环烯基、C_{1-6} 烷基磺酰基、C_{1-6} 烷基亚磺酰基、三 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基、三 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基 (C_{1-6}) 烷 氧基、芳基二 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基、(C_{1-4}) 烷基二芳基甲硅烷基和三芳基甲硅烷基中的一种或多种。

[0033] 优选烯基或炔基上任选的取代基包括卤素、芳基和 C_{3-7} 环烷基中的一种或多种。

[0034] 优选杂环基任选的取代基是 C_{1-6} 烷基。

[0035] 优选环烷基任选的取代基包括卤素、氰基和 C_{1-3} 烷基。

[0036] 优选环烯基任选的取代基包括 C_{1-3} 烷基、卤素和氰基。

[0037] 基团 T、Y、Ra、R^1、R^2、R^4 和 R^8 在任一种组合中的优选基团如下所示。

[0038] 优选 Y 是单键、C ＝ O 或 C ＝ S。

[0039] 更优选 Y 是单键或 C ＝ O。

[0040] 最优选 Y 是 C ＝ O。

[0041] 优选 R^1 是氢、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 氰基烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{3-7} 环烷基 (C_{1-4}) 烷基、C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基、杂芳基 (C_{1-6}) 烷基（其中杂芳基可任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-6} 卤代烷氧基、C_{1-6} 烷基磺酰基、C_{1-6} 烷基亚磺酰基、C_{1-6} 烷硫基、C_{1-6} 烷氧基羰基、C_{1-6} 烷基羰基氨基、芳基羰基取代，或杂芳环上两相邻位置可成环形成 5、6 或 7 元任选被卤素取代的碳环或杂环）、芳基 (C_{1-6}) 烷基（其中芳基可任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-6} 卤代烷氧基、C_{1-6} 烷基磺酰基、C_{1-6} 烷基亚磺酰基、C_{1-6} 烷硫基、C_{1-6} 烷氧基羰基、C_{1-6} 烷基羰基氨基、芳基羰基取代，或芳基上两相邻位置可成环形成 5、6 或 7 元任选被卤素取代的碳环或杂环）、C_{1-6} 烷基羰基氨基 (C_{1-6}) 烷基、芳基（其可任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-6} 卤代烷氧基、C_{1-6} 烷基磺酰基、C_{1-6} 烷基亚磺酰基、C_{1-6} 烷硫基、C_{1-6} 烷氧基羰基、C_{1-6} 烷基羰基氨基、芳基羰基取代，或芳基上两相邻位置可成环形成 5、6 或 7 元任选被卤素取代的碳环或杂环）、杂芳基（其可任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-6} 卤代烷氧基、C_{1-6} 烷基磺酰基、C_{1-6} 烷基亚磺酰基、C_{1-6} 烷硫基、C_{1-6} 烷氧基羰基、C_{1-6} 烷基羰基氨基、芳基羰基取代，或杂芳基 上两相邻位置可成环形成 5、6 或 7 元任选被卤素取代的碳环或杂环）、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-6} 卤代烷氧基、苯氧基（其中苯基任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）、杂芳氧基（任选被卤素、硝基、氰

基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代）、杂环氧基（任选被卤素、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代）、氰基、C_{2-6} 烯基、C_{2-6} 炔基、C_{3-6} 环烷基、C_{5-7} 环烯基、杂环基（任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代）、C_{1-6} 烷硫基、C_{1-6} 卤代烷硫基或 $NR^{13}R^{14}$，其中 R^{13} 和 R^{14} 独立地是氢、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基、苯基（其可任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基、二烷基氨基或 C_{1-4} 烷氧羰基取代）、苯基 (C_{1-6}) 烷基（其中苯基可任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基、二烷基氨基、C_{1-6} 烷基磺酰基、C_{1-6} 烷氧羰基取代，或苯环上两相邻位置可成环形成 5、6 或 7 元任选被卤素取代的碳环或杂环）、杂芳基 (C_{1-6}) 烷基（其中杂芳基可任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-6} 卤代烷氧基、C_{1-6} 烷基磺酰基、C_{1-6} 烷基亚磺酰基、C_{1-6} 烷硫基、C_{1-6} 烷氧基羰基、C_{1-6} 烷基羰基氨基、芳基羰基取代，或杂芳环上两相邻位置可成环形成 5、6 或 7 元任选被卤素取代的碳环或杂环）或杂芳基（其可任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基、C_{1-4} 烷氧基羰基、C_{1-6} 烷基羰基氨基、苯氧基羰基氨基（其中苯基任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）、氨基、C_{1-6} 烷基氨基或苯氨基（其中苯基任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）取代）。

[0042] 更优选的 R^1 是 C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基、杂芳基 (C_{1-3}) 烷基（其中杂芳基可任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-6} 卤代烷氧基、C_{1-6} 烷基磺酰基、C_{1-6} 烷基羰基 取代，或杂芳环上两相邻位置可成环形成任选被卤素取代的 5、6 或 7 元碳环或杂环）、苯基 (C_{1-3}) 烷基（其中苯基可任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基、二烷基氨基、C_{1-6} 烷基磺酰基、C_{1-6} 烷氧羰基取代，或苯环上两相邻位置可成环形成 5、6 或 7 元任选被卤素取代的碳环或杂环）、苯基（其可任选被被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基、二烷基氨基、C_{1-6} 烷基磺酰基、C_{1-6} 烷氧羰基取代，或苯环上两相邻位置可成环形成 5、6 或 7 元任选被卤素取代的碳环或杂环）、杂芳基（其可任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-6} 卤代烷氧基、C_{1-6} 烷基磺酰基、C_{1-6} 烷氧基羰基取代，或杂芳环上两相邻位置可成环形成 5、6 或 7 元任选被卤素取代的碳环或杂环）、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-6} 卤代烷氧基、C_{2-6} 烯基、杂环基（其任选被卤素、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代）、C_{1-6} 烷硫基、C_{1-6} 卤代烷硫基或 $NR^{13}R^{14}$，其中 R^{13} 和 R^{14} 独立地是氢、C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基、C_{2-6} 烷基羰基、苯基羰基（其中苯基可任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）、苯基 (C_{1-3}) 烷基（其中苯基可任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基、二烷基氨基、C_{1-6} 烷基磺酰基、C_{1-6} 烷氧基羰基取代，或苯环上两相邻位置可成环形成 5、6 或 7 元任选被卤素取代的碳环或杂环）或杂芳基 (C_{1-3}) 烷基（其中杂芳基可任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-6} 卤代烷氧基、C_{1-6} 烷基磺酰基、C_{1-6} 烷基亚磺酰基、C_{1-6} 烷硫基、C_{1-6} 烷氧基羰基、C_{1-6} 烷基羰基氨基、芳基羰基取代，或杂芳环上两相邻位置可成环形成 5、6 或 7 元任选被卤素取代的碳环或杂环）。

[0043] 甚至更优选的 R^1 是 C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、杂芳基 (C_{1-3}) 烷基（其中杂芳基可任选被卤素、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基取代，并且所述杂芳基是噻唑、吡啶、嘧啶、吡嗪或哒嗪）、杂芳基（其可任选被卤素、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基取代，并且所述杂芳基是吡啶、嘧啶、2,1,3- 苯并噁二唑、吡嗪或哒嗪）、C_{1-6} 烷氧基、C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基、C_{1-6} 烷基氨基、C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基氨基或杂芳基 (C_{1-3}) 烷基氨基（其中所述杂芳基可任选被卤素、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基取代，并且所述杂芳基是噻唑、吡啶、嘧啶、吡嗪或哒嗪）。

[0044] 最优选的是 R^1 为吡啶基（任选被卤素、C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 卤代烷基取代），特别是卤代吡啶。

[0045] 优选的是 R^2 为氢、羟基、C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 卤代烷基。

[0046] 最优选的是 R^2 为氢、C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 卤代烷基。

[0047] 更优选的是 R^2 为氢或 C_{1-4} 烷基。

[0048] 仍更优选的是 R^2 独立地是氢或甲基。

[0049] 最优选的 R^2 是氢。

[0050] 优选的是 R^4 各自独立地为卤素、氰基、C_{1-8} 烷基、C_{1-8} 卤代烷基、C_{1-6} 氰基烷基、C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基、C_{3-7} 环烷基 (C_{1-6}) 烷基、C_{5-6} 环烯基 (C_{1-6}) 烷基、C_{3-6} 烯氧基 (C_{1-6}) 烷基、C_{3-6} 炔氧基 (C_{1-6}) 烷基、芳氧基 (C_{1-6}) 烷基、C_{1-6} 羧基烷基、C_{1-6} 烷基羰基 (C_{1-6}) 烷基、C_{2-6} 烯基羰基 (C_{1-6}) 烷基、C_{2-6} 炔基羰基 (C_{1-6}) 烷基、C_{1-6} 烷氧羰基 (C_{1-6}) 烷基、C_{3-6} 烯氧基羰基 (C_{1-6}) 烷基、C_{3-6} 炔基羰基 (C_{1-6}) 烷基、芳氧基羰基 (C_{1-6}) 烷基、C_{1-6} 烷硫基 (C_{1-6}) 烷基、C_{1-6} 烷基亚磺酰基 (C_{1-6}) 烷基、C_{1-6} 烷基磺酰基 (C_{1-6}) 烷基、氨基羰基 (C_{1-6}) 烷基、C_{1-6} 烷基氨基羰基 (C_{1-6}) 烷基、二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基 (C_{1-6}) 烷基、苯基 (C_{1-4}) 烷基（其中苯基任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）、杂芳基 (C_{1-4}) 烷基（其中杂芳基任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代）、杂环基 (C_{1-4}) 烷基（其中杂环基任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代）、C_{2-6} 烯基、氨基羰基 (C_{2-6}) 烯基、C_{1-6} 烷基氨基羰基 (C_{2-6}) 烯基、二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基 (C_{2-6}) 烯基、苯基 (C_{2-4}) 烯基（其中苯基任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）、C_{2-6} 炔基、三甲硅烷基 (C_{2-6}) 炔基、氨基羰基 (C_{2-6}) 炔基、C_{1-6} 烷基氨基羰基 (C_{2-6}) 炔基、二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基 (C_{2-6}) 炔基、C_{1-6} 烷氧羰基、C_{3-7} 环烷基、C_{3-7} 卤代环烷基、C_{3-7} 氰基环烷基、C_{1-3} 烷基 (C_{3-7}) 环烷基、C_{1-3} 烷基 (C_{3-7}) 卤代环烷基、苯基（任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）、杂芳基（被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代）、杂环基（其中杂环基任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代），或 2 个相邻的 R^4 与它们所相连的碳原子一起形成 4、5、6 或 7 元碳环或杂环，所述杂环或碳环可任选被卤素、C_{1-8} 烷氧基、C_{1-6} 卤代烷氧基、苯氧基（任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代）、杂芳氧基（任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代）、C_{1-8} 烷硫基或 $R^{19}R^{20}N$ 取代，其中 R^{19} 和 R^{20} 独立地是氢、C_{1-8} 烷基、C_{3-7} 环烷基、C_{3-6} 烯基、C_{3-6} 炔基、C_{2-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧羰基或 R^{19} 和 R^{20} 与它们所相连的 N 原子一起形成五、六或七元杂环，所述杂环可进一步含有一个或两个选自 O、N 或 S 的杂原子并且其任选

被一个或两个 C_{1-6} 烷基取代；n 是 0、1、2 或 3。

[0051] 甚至更优选 R^4 各自独立地是卤素、氰基、C_{1-8} 烷基、C_{1-8} 卤代烷基、C_{1-8} 氰基烷基、C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基、C_{2-6} 炔基、三甲硅烷基 (C_{2-6}) 炔基、C_{1-6} 烷氧基羰基、C_{3-7} 环烷基、C_{1-3} 烷基 (C_{3-7}) 环烷基、苯基（任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）、杂环基（任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-6} 烷基、C_{1-6} 卤代烷基、C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代）、C_{1-8} 烷氧基、C_{1-6} 卤代烷氧基、苯氧基（任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）、杂芳氧基（任选被卤素、硝基、氰基、C_{1-3} 烷基、C_{1-3} 卤代烷基、C_{1-3} 烷氧基或 C_{1-3} 卤代烷氧基取代）、二 (C_{1-8}) 烷氨基或 2 个相邻的 R^4 与它们所相连的碳原子一起形成 4、5、6 或 7 元碳环或杂环，所述杂环或碳环可任选被卤素取代；n 是 0、1、2 或 3。

[0052] 甚至更优选的 R^4 各自独立地是卤素、氰基、C_{1-8} 烷基、C_{1-8} 卤代烷基、C_{1-8} 氰基烷基、C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基、C_{2-6} 炔基、杂环基（任选被 C_{1-6} 烷基取代）、C_{1-8} 烷氧基、C_{1-6} 卤代烷氧基、苯氧基（任选被卤素、氰基、C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 卤代烷基取代）、杂芳氧基（任选被卤素、氰基、C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 卤代烷基取代）、二 (C_{1-8}) 烷基氨基或 2 个相邻的 R^4 与它们所相连的碳原子一起形成 4、5、6 或 7 元碳环或杂环，所述杂环或碳环可任选被卤素取代；n 是 0、1、2 或 3。

[0053] 仍然优选的是 R^4 独立地是氟、氯、溴、氰基、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 氰基烷基或 C_{1-3} 烷氧基 (C_{1-3}) 烷基；n 是 0、1、2 或 3，优选 0、1 或 2。

[0054] 最优选的是 R^4 各自独立地是氟、氯、溴、C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 卤代烷基；n 是 1、2 或 3，优选 1 或 2。

[0055] 优选 R^8 是 C_{1-10} 烷基、C_{1-10} 卤代烷基、芳基 (C_{1-6}) 烷基（其中芳基任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）、杂芳基 (C_{1-6}) 烷基（其中杂芳基任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）、芳基羰基-(C_{1-6}) 烷基（其中所述芳基可任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代，和所述烷基可任选被芳基取代）、C_{2-8} 烯基、C_{2-8} 卤代烯基、芳基 (C_{2-6})-烯基（其中芳基任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基、C_{1-6} 烷氧基羰基取代，或两相邻取代基可成环形成 5、6 或 7 元碳环或杂环）、杂芳基 (C_{2-6})-烯基（其中杂芳基任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基、C_{1-6} 烷氧基羰基取代，或两相邻取代基可成环形成 5、6 或 7 元碳环或杂环）、C_{2-6} 炔基、苯基 (C_{2-6}) 炔基（其中苯基任选被卤素、C_{1-6} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）、C_{3-7} 环烷基、C_{1-6} 烷氧羰基、C_{1-6} 烷基羰基、C_{1-6} 卤代烷基羰基或芳基 (C_{2-6}) 烯基羰基（其中芳基可任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）或 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$，其中 z 是 1 或 2，$R^{51}$ 和 R^{52} 各自独立地是 H、卤素或 C_{1-2} 烷基，R^{53} 和 R^{54} 各自独立地是 H、卤素、C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 卤代烷基以及 R^{55} 是任选取代的芳基或任选取代的杂芳基。

[0056] 更优选的是 R^8 是苯基 (C_{1-4}) 烷基（其中苯基任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4}

卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）、杂芳基（C_{1-6}）烷基（其中杂芳基任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）、苯基（C_{2-6}）烯基（其中苯基任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）、杂芳基（C_{2-6}）烯基（其中杂芳基任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）或苯基（C_{2-6}）炔基（其中苯基任选被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代）或 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$，其中 z 是 1 或 2，$R^{51}$ 和 R^{52} 各自独立地是 H、卤素或 C_{1-2} 烷基，R^{53} 和 R^{54} 各自独立地是 H、卤素、C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 卤代烷基以及 R^{55} 是任选取代的芳基或任选取代的杂芳基。

[0057] 最优选的 R^8 是 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$，其中 z 是 1 或 2，优选 1，$R^{51}$ 和 R^{52} 各自独立地是 H 或 C_{1-2} 烷基，R^{53} 和 R^{54} 各自独立地是 H、卤素、C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 卤代烷基以及 R^{55} 是被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代的苯基或被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代的杂芳基。

[0058] 优选 R^{51} 和 R^{52} 是氢。

[0059] 优选 R^{53} 和 R^{54} 是氢或卤素，尤其是氢。

[0060] 优选 R^{55} 是被一至三个选自卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基的取代基取代的苯基。

[0061] 优选 Ra 各自独立地是卤素、氰基、C_{1-3} 烷基、羟基或两个 Ra 基团与它们所相连的碳原子一起形成＝O、＝S、＝NRb、＝CRcRd，其中 Rb、Rc 和 Rd 独立地是 H 或任选被取代的烷基，以及 p 是 0、1 或 2。

[0062] 最优选的是 Ra 各自独立地是氟、甲基、羟基或两个 Ra 基团与它们所相连的碳原子一起形成羰基，以及 p 是 0、1 或 2。

[0063] 最优选的是 P 为 0。

[0064] 优选的环

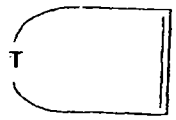
[0065]



[0066] 是 6- 元芳环或 5 或 6 元杂芳环，其中环原子各自独立地为 CH、S、N、NR^4、O 或 CR^4，条件是至少一个环原子不是 CH 或 CR^4 且环中至多存在一个 O 或 S 原子。

[0067] 更优选的环

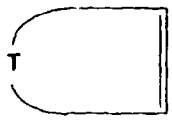
[0068]



[0069] 是苯、吡啶、嘧啶、吡嗪、哒嗪、三嗪、呋喃、噻吩、吡咯、咪唑、吡唑、噁唑、噻唑、异噁唑、异噻唑、[1,2,3] 三唑，[1,2,3] 噁二唑或 [1,2,3] 噻二唑。

[0070] 最优选的是环

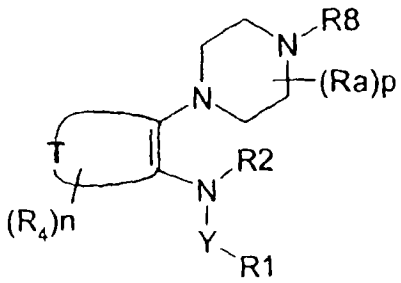
[0071]



[0072] 为苯环或吡啶环。

[0073] 一些式 (I) 的化合物是新的并因此形成本发明的另一个方面。一种式 I′ 的新化合物

[0074]



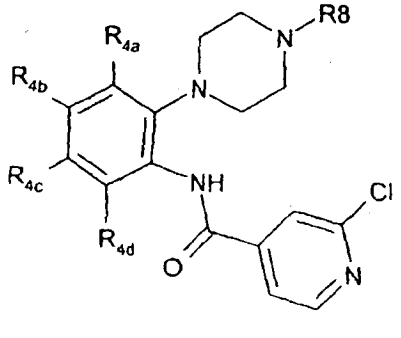
(I')

[0075] 其中 R^1、R^2、R^4、Ra、T、Y、n 和 p 如式 I 中所定义，R^8 是 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$，其中 z 是 1 或 2，优选 1，$R^{51}$ 和 R^{52} 各自独立地是 H 或 C_{1-2} 烷基，R^{53} 和 R^{54} 各自独立地是 H、卤素、C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 卤代烷基以及 R^{55} 是被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代的苯基或被卤素、C_{1-4} 烷基、C_{1-4} 烷氧基、C_{1-4} 卤代烷基、C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、NO_2、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代的杂芳基。

[0076] 通过下表 I 至 XXV 中的化合物来举例说明本发明化合物。

[0077] 表 1 中提供了 897 种式 Ia 的化合物

[0078]



(Ia)

[0079] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0080] 表 1

[0081]

化合物	R^8	R^{4a}	R^{4b}	R^{4c}	R^{4d}
I-1	4- 氯苄基	H	H	H	H
I-2	肉桂基	H	H	H	H
I-3	4- 氯肉桂基	H	H	H	H
I-4	4- 氟肉桂基	H	H	H	H
I-5	4- 溴肉桂基	H	H	H	H
I-6	4- 三氟甲基肉桂基	H	H	H	H
I-7	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	H	H	H

[0082]

I-8	4- 五氟乙氧肉桂基	H	H	H	H
I-9	4- 甲氧肉桂基	H	H	H	H
I-10	4- 乙氧肉桂基	H	H	H	H
I-11	4- 氰基肉桂基	H	H	H	H
I-12	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	H	H	H
I-13	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	H	H	H
I-14	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	H	H	H
I-15	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	H	H	H
I-16	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	H	H	H
I-17	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	H	H	H
I-18	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	H	H	H
I-19	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	H	H	H
I-20	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	H	H	H
I-21	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	H	H	H
I-22	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	H	H	H
I-23	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	H	H	H
I-24	4- 氯苄基	H	F	H	H
I-25	肉桂基	H	F	H	H
I-26	4- 氯肉桂基	H	F	H	H
I-27	4- 氟肉桂基	H	F	H	H
I-28	4- 溴肉桂基	H	F	H	H
I-29	4- 三氟甲基肉桂基	H	F	H	H
I-30	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	F	H	H
I-31	4- 五氟乙氧肉桂基	H	F	H	H
I-32	4- 甲氧肉桂基	H	F	H	H
I-33	4- 乙氧肉桂基	H	F	H	H
I-34	4- 氰基肉桂基	H	F	H	H
I-35	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	F	H	H
I-36	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	F	H	H
I-37	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	F	H	H
I-38	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	F	H	H
I-39	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	F	H	H
I-40	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	F	H	H
I-41	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	F	H	H
I-42	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	F	H	H
I-43	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	F	H	H
I-44	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	F	H	H
I-45	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	F	H	H
I-46	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	F	H	H
I-47	4- 氯苄基	H	Cl	H	H
I-48	肉桂基	H	Cl	H	H
I-49	4- 氯肉桂基	H	Cl	H	H
I-50	4- 氟肉桂基	H	Cl	H	H
I-51	4- 溴肉桂基	H	Cl	H	H
I-52	4- 三氟甲基肉桂基	H	Cl	H	H
I-53	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	Cl	H	H
I-54	4- 五氟乙氧肉桂基	H	Cl	H	H
I-55	4- 甲氧肉桂基	H	Cl	H	H
I-56	4- 乙氧肉桂基	H	Cl	H	H

[0082]

I-57	4- 氰基肉桂基	H	Cl	H	H
I-58	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	Cl	H	H
I-59	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	Cl	H	H
I-60	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	Cl	H	H
I-61	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	Cl	H	H
I-62	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	Cl	H	H
I-63	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	Cl	H	H
I-64	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	Cl	H	H
I-65	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	Cl	H	H
I-66	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	Cl	H	H
I-67	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	Cl	H	H
I-68	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	Cl	H	H
I-69	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	Cl	H	H
I-70	4- 氯苄基	H	H	F	H
I-71	肉桂基	H	H	F	H
I-72	4- 氯肉桂基	H	H	F	H
I-73	4- 氟肉桂基	H	H	F	H
I-74	4- 溴肉桂基	H	H	F	H
I-75	4- 三氟甲基肉桂基	H	H	F	H
I-76	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	H	F	H
I-77	4- 五氟乙氧肉桂基	H	H	F	H
I-78	4- 甲氧肉桂基	H	H	F	H
I-79	4- 乙氧肉桂基	H	H	F	H
I-80	4- 氰基肉桂基	H	H	F	H
I-81	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	H	F	H
I-82	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	H	F	H
I-83	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	H	F	H
I-84	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	H	F	H
I-85	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	H	F	H
I-86	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	H	F	H
I-87	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	H	F	H
I-88	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	H	F	H
I-89	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	H	F	H
I-90	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	H	F	H
I-91	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	H	F	H
I-92	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	H	F	H
I-93	4- 氯苄基	H	H	Cl	H
I-94	肉桂基	H	H	Cl	H
I-95	4- 氯肉桂基	H	H	Cl	H
I-96	4- 氟肉桂基	H	H	Cl	H
I-97	4- 溴肉桂基	H	H	Cl	H
I-98	4- 三氟甲基肉桂基	H	H	Cl	H
I-99	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	H	Cl	H
I-100	4- 五氟乙氧肉桂基	H	H	Cl	H
I-101	4- 甲氧肉桂基	H	H	Cl	H
I-102	4- 乙氧肉桂基	H	H	Cl	H
I-103	4- 氰基肉桂基	H	H	Cl	H
I-104	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	H	Cl	H
I-105	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	H	Cl	H
I-106	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	H	Cl	H
I-107	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	H	Cl	H

[0083]

I-108	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	H	Cl	H
I-109	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	H	Cl	H
I-110	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	H	Cl	H
I-111	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	H	Cl	H
I-112	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	H	Cl	H
I-113	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	H	Cl	H
I-114	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	H	Cl	H
I-115	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	H	Cl	H
I-116	4- 氯苄基	Cl	Cl	H	H
I-117	肉桂基	Cl	Cl	H	H
I-118	4- 氯肉桂基	Cl	Cl	H	H
I-119	4- 氟肉桂基	Cl	Cl	H	H
I-120	4- 溴肉桂基	Cl	Cl	H	H
I-121	4- 三氟甲基肉桂基	Cl	Cl	H	H
I-122	4- 三氟甲氧基肉桂基	Cl	Cl	H	H
I-123	4- 五氟乙氧肉桂基	Cl	Cl	H	H
I-124	4- 甲氧肉桂基	Cl	Cl	H	H
I-125	4- 乙氧肉桂基	Cl	Cl	H	H
I-126	4- 氰基肉桂基	Cl	Cl	H	H
I-127	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-128	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	Cl	Cl	H	H
I-129	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-130	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	Cl	Cl	H	H
I-131	3,5- 二氯 - 肉桂基	Cl	Cl	H	H
I-132	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	Cl	Cl	H	H
I-133	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	Cl	Cl	H	H
I-134	3- 萘 -2- 基烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-135	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-135	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-137	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-138	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-139	4- 氯苄基	F	F	H	H
I-140	肉桂基	F	F	H	H
I-141	4- 氯肉桂基	F	F	H	H
I-142	4- 氟肉桂基	F	F	H	H
I-143	4- 溴肉桂基	F	F	H	H
I-144	4- 三氟甲基肉桂基	F	F	H	H
I-145	4- 三氟甲氧基肉桂基	F	F	H	H
I-146	4- 五氟乙氧肉桂基	F	F	H	H
I-147	4- 甲氧肉桂基	F	F	H	H
I-148	4- 乙氧肉桂基	F	F	H	H
I-149	4- 氰基肉桂基	F	F	H	H
I-150	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	F	F	H	H
I-151	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	F	F	H	H
I-152	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	F	F	H	H
I-153	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	F	F	H	H
I-154	3,5- 二氯 - 肉桂基	F	F	H	H
I-155	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	F	F	H	H
I-156	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	F	F	H	H
I-157	3- 萘 -2- 基烯丙基	F	F	H	H
I-158	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	F	F	H	H

[0084]

I-159	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	F	F	H	H
I-160	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	F	H	H
I-161	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	F	F	H	H
I-162	4-氯苄基	F	H	F	H
I-163	肉桂基	F	H	F	H
I-164	4-氯肉桂基	F	H	F	H
I-165	4-氟肉桂基	F	H	F	H
I-166	4-溴肉桂基	F	H	F	H
I-167	4-三氟甲基肉桂基	F	H	F	H
I-168	4-三氟甲氧基肉桂基	F	H	F	H
I-169	4-五氟乙氧肉桂基	F	H	F	H
I-170	4-甲氧肉桂基	F	H	F	H
I-171	4-乙氧肉桂基	F	H	F	H
I-172	4-氰基肉桂基	F	H	F	H
I-173	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	F	H	F	H
I-174	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	F	H	F	H
I-175	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	F	H	F	H
I-176	3-氯-4-氟-肉桂基	F	H	F	H
I-177	3,5-二氯-肉桂基	F	H	F	H
I-178	5-苯基-戊-2,4-二烯基	F	H	F	H
I-179	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	F	H	F	H
I-180	3-萘-2-基烯丙基	F	H	F	H
I-181	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	F	H
I-182	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	F	H
I-183	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	H	F	H
I-184	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	F	H	F	H
I-185	4-氯苄基	F	H	H	F
I-186	肉桂基	F	H	H	F
I-187	4-氯肉桂基	F	H	H	F
I-188	4-氟肉桂基	F	H	H	F
I-189	4-溴肉桂基	F	H	H	F
I-190	4-三氟甲基肉桂基	F	H	H	F
I-191	4-三氟甲氧基肉桂基	F	H	H	F
I-192	4-五氟乙氧肉桂基	F	H	H	F
I-193	4-甲氧肉桂基	F	H	H	F
I-194	4-乙氧肉桂基	F	H	H	F
I-195	4-氰基肉桂基	F	H	H	F
I-196	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	F	H	H	F
I-197	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	F	H	H	F
I-198	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	F	H	H	F
I-199	3-氯-4-氟-肉桂基	F	H	H	F
I-200	3,5-二氯-肉桂基	F	H	H	F
I-201	5-苯基-戊-2,4-二烯基	F	H	H	F
I-202	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	F	H	H	F
I-203	3-萘-2-基烯丙基	F	H	H	F
I-204	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	H	F
I-205	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	H	F
I-206	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	H	H	F
I-207	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	F	H	H	F
I-208	4-氯苄基	Cl	H	Cl	H
I-209	肉桂基	Cl	H	Cl	H

[0085]

I-210	4-氯肉桂基	Cl	H	Cl	H
I-211	4-氟肉桂基	Cl	H	Cl	H
I-212	4-溴肉桂基	Cl	H	Cl	H
I-213	4-三氟甲基肉桂基	Cl	H	Cl	H
I-214	4-三氟甲氧基肉桂基	Cl	H	Cl	H
I-215	4-五氟乙氧肉桂基	Cl	H	Cl	H
I-216	4-甲氧肉桂基	Cl	H	Cl	H
I-217	4-乙氧肉桂基	Cl	H	Cl	H
I-218	4-氰基肉桂基	Cl	H	Cl	H
I-219	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-220	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	Cl	H	Cl	H
I-221	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-222	3-氯-4-氟-肉桂基	Cl	H	Cl	H
I-223	3,5-二氯-肉桂基	Cl	H	Cl	H
I-224	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	H	Cl	H
I-225	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	Cl	H	Cl	H
I-226	3-萘-2-基烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-227	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-228	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-229	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-230	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-231	4-氯苄基	Cl	H	H	Cl
I-232	肉桂基	Cl	H	H	Cl
I-233	4-氯肉桂基	Cl	H	H	Cl
I-234	4-氟肉桂基	Cl	H	H	Cl
I-235	4-溴肉桂基	Cl	H	H	Cl
I-236	4-三氟甲基肉桂基	Cl	H	H	Cl
I-237	4-三氟甲氧基肉桂基	Cl	H	H	Cl
I-238	4-五氟乙氧肉桂基	Cl	H	H	Cl
I-239	4-甲氧肉桂基	Cl	H	H	Cl
I-240	4-乙氧肉桂基	Cl	H	H	Cl
I-241	4-氰基肉桂基	Cl	H	H	Cl
I-242	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-243	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	Cl	H	H	Cl
I-244	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-245	3-氯-4-氟-肉桂基	Cl	H	H	Cl
I-246	3,5-二氯-肉桂基	Cl	H	H	Cl
I-247	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	H	H	Cl
I-248	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	Cl	H	H	Cl
I-249	3-萘-2-基烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-250	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-251	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-252	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-253	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-254	4-氯苄基	F	Cl	H	H
I-255	肉桂基	F	Cl	H	H
I-256	4-氯肉桂基	F	Cl	H	H
I-257	4-氟肉桂基	F	Cl	H	H
I-258	4-溴肉桂基	F	Cl	H	H
I-259	4-三氟甲基肉桂基	F	Cl	H	H
I-260	4-三氟甲氧基肉桂基	F	Cl	H	H

[0087]

[0086]

I-261	4- 五氟乙氧肉桂基	F	Cl	H	H
I-262	4- 甲氧肉桂基	F	Cl	H	H
I-263	4- 乙氧肉桂基	F	Cl	H	H
I-264	4- 氰基肉桂基	F	Cl	H	H
I-265	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	F	Cl	H	H
I-266	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	F	Cl	H	H
I-267	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	F	Cl	H	H
I-268	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	F	Cl	H	H
I-269	3,5- 二氯 - 肉桂基	F	Cl	H	H
I-270	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	F	Cl	H	H
I-271	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	F	Cl	H	H
I-272	3- 萘 -2- 基烯丙基	F	Cl	H	H
I-273	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	F	Cl	H	H
I-274	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	F	Cl	H	H
I-275	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	F	Cl	H	H
I-276	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	F	Cl	H	H
I-277	4- 氯苄基	F	H	Cl	H
I-278	肉桂基	F	H	Cl	H
I-279	4- 氯肉桂基	F	H	Cl	H
I-280	4- 氟肉桂基	F	H	Cl	H
I-281	4- 溴肉桂基	F	H	Cl	H
I-282	4- 三氟甲基肉桂基	F	H	Cl	H
I-283	4- 三氟甲氧基肉桂基	F	H	Cl	H
I-284	4- 五氟乙氧肉桂基	F	H	Cl	H
I-285	4- 甲氧肉桂基	F	H	Cl	H
I-286	4- 乙氧肉桂基	F	H	Cl	H
I-287	4- 氰基肉桂基	F	H	Cl	H
I-288	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	F	H	Cl	H
I-289	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	F	H	Cl	H
I-290	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	F	H	Cl	H
I-291	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	F	H	Cl	H
I-292	3,5- 二氯 - 肉桂基	F	H	Cl	H
I-293	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	F	H	Cl	H
I-294	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	F	H	Cl	H
I-295	3- 萘 -2- 基烯丙基	F	H	Cl	H
I-296	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	F	H	Cl	H
I-297	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	F	H	Cl	H
I-298	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	F	H	Cl	H
I-299	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	F	H	Cl	H
I-300	4- 氯苄基	F	H	H	Cl
I-301	肉桂基	F	H	H	Cl
I-302	4- 氯肉桂基	F	H	H	Cl
I-303	4- 氟肉桂基	F	H	H	Cl
I-304	4- 溴肉桂基	F	H	H	Cl
I-305	4- 三氟甲基肉桂基	F	H	H	Cl
I-306	4- 三氟甲氧基肉桂基	F	H	H	Cl
I-307	4- 五氟乙氧肉桂基	F	H	H	Cl
I-308	4- 甲氧肉桂基	F	H	H	Cl
I-309	4- 乙氧肉桂基	F	H	H	Cl
I-310	4- 氰基肉桂基	F	H	H	Cl
I-311	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	F	H	H	Cl

[0087]

I-312	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	F	H	H	Cl
I-313	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	F	H	H	Cl
I-314	3-氯-4-氟-肉桂基	F	H	H	Cl
I-315	3,5-二氯-肉桂基	F	H	H	Cl
I-316	5-苯基-戊-2,4-二烯基	F	H	H	Cl
I-317	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	F	H	H	Cl
I-318	3-萘-2-基烯丙基	F	H	H	Cl
I-319	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	H	Cl
I-320	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	H	Cl
I-321	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	H	H	Cl
I-322	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	F	H	H	Cl
I-323	4-氯苄基	Cl	F	H	H
I-324	肉桂基	Cl	F	H	H
I-325	4-氯肉桂基	Cl	F	H	H
I-326	4-氟肉桂基	Cl	F	H	H
I-327	4-溴肉桂基	Cl	F	H	H
I-328	4-三氟甲基肉桂基	Cl	F	H	H
I-329	4-三氟甲氧基肉桂基	Cl	F	H	H
I-330	4-五氟乙氧肉桂基	Cl	F	H	H
I-331	4-甲氧肉桂基	Cl	F	H	H
I-332	4-乙氧肉桂基	Cl	F	H	H
I-333	4-氰基肉桂基	Cl	F	H	H
I-334	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	F	H	H
I-335	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	Cl	F	H	H
I-336	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	Cl	F	H	H
I-337	3-氯-4-氟-肉桂基	Cl	F	H	H
I-338	3,5-二氯-肉桂基	Cl	F	H	H
I-339	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	F	H	H
I-340	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	Cl	F	H	H
I-341	3-萘-2-基烯丙基	Cl	F	H	H
I-342	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	F	H	H
I-343	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	F	H	H
I-344	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	F	H	H
I-345	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	F	H	H
I-346	4-氯苄基	H	F	Cl	H
I-347	肉桂基	H	F	Cl	H
I-348	4-氯肉桂基	H	F	Cl	H
I-349	4-氟肉桂基	H	F	Cl	H
I-350	4-溴肉桂基	H	F	Cl	H
I-351	4-三氟甲基肉桂基	H	F	Cl	H
I-352	4-三氟甲氧基肉桂基	H	F	Cl	H
I-353	4-五氟乙氧肉桂基	H	F	Cl	H
I-354	4-甲氧肉桂基	H	F	Cl	H
I-355	4-乙氧肉桂基	H	F	Cl	H
I-356	4-氰基肉桂基	H	F	Cl	H
I-357	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	H	F	Cl	H
I-358	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	F	Cl	H

I-359	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	F	Cl	H
I-360	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	F	Cl	H
I-361	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	F	Cl	H
I-362	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	F	Cl	H
I-363	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	F	Cl	H
I-364	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	F	Cl	H
I-365	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	F	Cl	H
I-366	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	F	Cl	H
I-367	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	F	Cl	H
I-368	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	F	Cl	H
I-369	4- 氯苄基	H	F	H	Cl
I-370	肉桂基	H	F	H	Cl
I-371	4- 氯肉桂基	H	F	H	Cl
I-372	4- 氟肉桂基	H	F	H	Cl
I-373	4- 溴肉桂基	H	F	H	Cl
I-374	4- 三氟甲基肉桂基	H	F	H	Cl
I-375	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	F	H	Cl
I-376	4- 五氟乙氧肉桂基	H	F	H	Cl
I-377	4- 甲氧肉桂基	H	F	H	Cl
I-378	4- 乙氧肉桂基	H	F	H	Cl
I-379	4- 氰基肉桂基	H	F	H	Cl
I-380	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	F	H	Cl
I-381	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	F	H	Cl
I-382	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	F	H	Cl
I-383	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	F	H	Cl
I-384	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	F	H	Cl
I-385	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	F	H	Cl
I-386	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	F	H	Cl
I-387	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	F	H	Cl
I-388	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	F	H	Cl
I-389	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	F	H	Cl
I-390	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	F	H	Cl
I-391	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	F	H	Cl
I-392	4- 氯苄基	Cl	H	F	H
I-393	肉桂基	Cl	H	F	H
I-394	4- 氯肉桂基	Cl	H	F	H
I-395	4- 氟肉桂基	Cl	H	F	H
I-396	4- 溴肉桂基	Cl	H	F	H
I-397	4- 三氟甲基肉桂基	Cl	H	F	H
I-398	4- 三氟甲氧基肉桂基	Cl	H	F	H
I-399	4- 五氟乙氧肉桂基	Cl	H	F	H
I-400	4- 甲氧肉桂基	Cl	H	F	H
I-401	4- 乙氧肉桂基	Cl	H	F	H
I-402	4- 氰基肉桂基	Cl	H	F	H
I-403	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	Cl	H	F	H
I-404	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	Cl	H	F	H
I-405	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	Cl	H	F	H
I-406	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	Cl	H	F	H
I-407	3,5- 二氯 - 肉桂基	Cl	H	F	H
I-408	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	Cl	H	F	H
I-409	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	Cl	H	F	H
I-410	3- 萘 -2- 基烯丙基	Cl	H	F	H

I-411	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	F	H
I-412	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	F	H
I-413	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	H	F	H
I-414	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	H	F	H
I-415	4-氯苄基	H	Cl	F	H
I-416	肉桂基	H	Cl	F	H
I-417	4-氯肉桂基	H	Cl	F	H
I-418	4-氟肉桂基	H	Cl	F	H
I-419	4-溴肉桂基	H	Cl	F	H
I-420	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	F	H
I-421	4-三氟甲氧基肉桂基	H	Cl	F	H
I-422	4-五氟乙氧肉桂基	H	Cl	F	H
I-423	4-甲氧肉桂基	H	Cl	F	H
I-424	4-乙氧肉桂基	H	Cl	F	H
I-425	4-氰基肉桂基	H	Cl	F	H
I-426	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	H	Cl	F	H
I-427	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	Cl	F	H
I-428	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	H	Cl	F	H
I-429	3-氯-4-氟-肉桂基	H	Cl	F	H
I-430	3,5-二氯-肉桂基	H	Cl	F	H
I-431	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	Cl	F	H
I-432	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	Cl	F	H
I-433	3-萘-2-基烯丙基	H	Cl	F	H
I-434	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	F	H
I-435	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	F	H
I-436	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	Cl	F	H
I-437	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	H	Cl	F	H
I-438	4-氯苄基	H	H	F	Cl
I-439	肉桂基	H	H	F	Cl
I-440	4-氯肉桂基	H	H	F	Cl
I-441	4-氟肉桂基	H	H	F	Cl
I-442	4-溴肉桂基	H	H	F	Cl
I-443	4-三氟甲基肉桂基	H	H	F	Cl
I-444	4-三氟甲氧基肉桂基	H	H	F	Cl
I-445	4-五氟乙氧肉桂基	H	H	F	Cl
I-446	4-甲氧肉桂基	H	H	F	Cl
I-447	4-乙氧肉桂基	H	H	F	Cl
I-448	4-氰基肉桂基	H	H	F	Cl
I-449	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	H	H	F	Cl
I-450	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	H	F	Cl
I-451	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	H	H	F	Cl
I-452	3-氯-4-氟-肉桂基	H	H	F	Cl
I-453	3,5-二氯-肉桂基	H	H	F	Cl
I-454	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	H	F	Cl
I-455	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	H	F	Cl
I-456	3-萘-2-基烯丙基	H	H	F	Cl
I-457	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	F	Cl
I-458	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	F	Cl
I-459	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	H	F	Cl
I-460	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	H	H	F	Cl
I-461	4-氯苄基	Cl	H	H	F
I-462	肉桂基	Cl	H	H	F

I-463	4- 氯肉桂基	Cl	H	H	F
I-464	4- 氟肉桂基	Cl	H	H	F
I-465	4- 溴肉桂基	Cl	H	H	F
I-466	4- 三氟甲基肉桂基	Cl	H	H	F
I-467	4- 三氟甲氧基肉桂基	Cl	H	H	F
I-468	4- 五氟乙氧肉桂基	Cl	H	H	F
I-469	4- 甲氧肉桂基	Cl	H	H	F
I-470	4- 乙氧肉桂基	Cl	H	H	F
I-471	4- 氰基肉桂基	Cl	H	H	F
I-472	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	Cl	H	H	F
I-473	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	Cl	H	H	F
I-474	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	Cl	H	H	F
I-475	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	Cl	H	H	F
I-476	3,5- 二氯 - 肉桂基	Cl	H	H	F
I-477	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	Cl	H	H	F
I-478	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	Cl	H	H	F
I-479	3- 萘 -2- 基烯丙基	Cl	H	H	F
I-480	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	Cl	H	H	F
I-481	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	Cl	H	H	F
I-482	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	Cl	H	H	F
I-483	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	Cl	H	H	F
I-484	4- 氯苄基	H	Cl	H	F
I-485	肉桂基	H	Cl	H	F
I-486	4- 氯肉桂基	H	Cl	H	F
I-487	4- 氟肉桂基	H	Cl	H	F
I-488	4- 溴肉桂基	H	Cl	H	F
I-489	4- 三氟甲基肉桂基	H	Cl	H	F
I-490	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	Cl	H	F
I-491	4- 五氟乙氧肉桂基	H	Cl	H	F
I-492	4- 甲氧肉桂基	H	Cl	H	F
I-493	4- 乙氧肉桂基	H	Cl	H	F
I-494	4- 氰基肉桂基	H	Cl	H	F
I-495	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	Cl	H	F
I-496	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	Cl	H	F
I-497	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	Cl	H	F
I-498	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	Cl	H	F
I-499	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	Cl	H	F
I-500	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	Cl	H	F
I-501	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	Cl	H	F
I-502	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	Cl	H	F
I-503	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	Cl	H	F
I-504	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	Cl	H	F
I-505	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	Cl	H	F
I-506	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	Cl	H	F
I-507	4- 氯苄基	H	H	Cl	F
I-508	肉桂基	H	H	Cl	F
I-509	4- 氯肉桂基	H	H	Cl	F
I-510	4- 氟肉桂基	H	H	Cl	F

[0088]

I-511	4- 溴肉桂基	H	H	Cl	F
I-512	4- 三氟甲基肉桂基	H	H	Cl	F
I-513	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	H	Cl	F
I-514	4- 五氟乙氧肉桂基	H	H	Cl	F
I-515	4- 甲氧肉桂基	H	H	Cl	F
I-516	4- 乙氧肉桂基	H	H	Cl	F
I-517	4- 氰基肉桂基	H	H	Cl	F
I-518	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	H	Cl	F
I-519	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	H	Cl	F
I-520	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	H	Cl	F
I-521	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	H	Cl	F
I-522	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	H	Cl	F
I-523	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	H	Cl	F
I-524	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	H	Cl	F
I-525	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	H	Cl	F
I-526	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	H	Cl	F
I-527	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	H	Cl	F
I-528	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	H	Cl	F
I-529	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	H	Cl	F
I-530	4- 氯苄基	H	F	F	F
I-531	肉桂基	H	F	F	F
I-532	4- 氯肉桂基	H	F	F	F
I-533	4- 氟肉桂基	H	F	F	F
I-534	4- 溴肉桂基	H	F	F	F
I-535	4- 三氟甲基肉桂基	H	F	F	F
I-536	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	F	F	F
I-537	4- 五氟乙氧肉桂基	H	F	F	F
I-538	4- 甲氧肉桂基	H	F	F	F
I-539	4- 乙氧肉桂基	H	F	F	F
I-540	4- 氰基肉桂基	H	F	F	F
I-541	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	F	F	F
I-542	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	F	F	F
I-543	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	F	F	F
I-544	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	F	F	F
I-545	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	F	F	F
I-546	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	F	F	F
I-547	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	F	F	F
I-548	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	F	F	F
I-549	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	F	F	F
I-550	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	F	F	F
I-551	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	F	F	F
I-552	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	F	F	F
I-553	4- 氯苄基	F	H	F	F
I-554	肉桂基	F	H	F	F
I-555	4- 氯肉桂基	F	H	F	F
I-556	4- 氟肉桂基	F	H	F	F
I-557	4- 溴肉桂基	F	H	F	F
I-558	4- 三氟甲基肉桂基	F	H	F	F
I-559	4- 三氟甲氧基肉桂基	F	H	F	F
I-560	4- 五氟乙氧肉桂基	F	H	F	F
I-561	4- 甲氧肉桂基	F	H	F	F

[0089]

I-562	4- 乙氧肉桂基	F	H	F	F
I-563	4- 氰基肉桂基	F	H	F	F
I-564	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	F	H	F	F
I-565	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	F	H	F	F
I-566	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	F	H	F	F
I-567	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	F	H	F	F
I-568	3,5- 二氯 - 肉桂基	F	H	F	F
I-569	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	F	H	F	F
I-570	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	F	H	F	F
I-571	3- 萘 -2- 基烯丙基	F	H	F	F
I-572	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	F	H	F	F
I-573	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	F	H	F	F
I-574	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	F	H	F	F
I-575	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	F	H	F	F
I-576	4- 氯苄基	F	F	H	F
I-577	肉桂基	F	F	H	F
I-578	4- 氯肉桂基	F	F	H	F
I-579	4- 氟肉桂基	F	F	H	F
I-580	4- 溴肉桂基	F	F	H	F
I-581	4- 三氟甲基肉桂基	F	F	H	F
I-582	4- 三氟甲氧基肉桂基	F	F	H	F
I-583	4- 五氟乙氧肉桂基	F	F	H	F
I-584	4- 甲氧肉桂基	F	F	H	F
I-585	4- 乙氧肉桂基	F	F	H	F
I-586	4- 氰基肉桂基	F	F	H	F
I-587	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	F	F	H	F
I-588	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	F	F	H	F
I-589	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	F	F	H	F
I-590	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	F	F	H	F
I-591	3,5- 二氯 - 肉桂基	F	F	H	F
I-592	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	F	F	H	F
I-593	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	F	F	H	F
I-594	3- 萘 -2- 基烯丙基	F	F	H	F
I-595	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	F	F	H	F
I-596	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	F	F	H	F
I-597	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	F	F	H	F
I-598	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	F	F	H	F
I-599	4- 氯苄基	F	F	F	H
I-600	肉桂基	F	F	F	H
I-601	4- 氯肉桂基	F	F	F	H
I-602	4- 氟肉桂基	F	F	F	H
I-603	4- 溴肉桂基	F	F	F	H
I-604	4- 三氟甲基肉桂基	F	F	F	H
I-605	4- 三氟甲氧基肉桂基	F	F	F	H
I-606	4- 五氟乙氧肉桂基	F	F	F	H
I-607	4- 甲氧肉桂基	F	F	F	H
I-608	4- 乙氧肉桂基	F	F	F	H
I-609	4- 氰基肉桂基	F	F	F	H
I-610	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	F	F	F	H
I-611	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	F	F	F	H

[0090]

I-612	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	F	F	F	H
I-613	3-氯-4-氟-肉桂基	F	F	F	H
I-614	3,5-二氯-肉桂基	F	F	F	H
I-615	5-苯基-戊-2,4-二烯基	F	F	F	H
I-616	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	F	F	F	H
I-617	3-萘-2-基烯丙基	F	F	F	H
I-618	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	F	F	H
I-619	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	F	F	F	H
I-620	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	F	F	H
I-621	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	F	F	F	H
I-622	4-氯苄基	H	Cl	Cl	Cl
I-623	肉桂基	H	Cl	Cl	Cl
I-624	4-氯肉桂基	H	Cl	Cl	Cl
I-625	4-氟肉桂基	H	Cl	Cl	Cl
I-626	4-溴肉桂基	H	Cl	Cl	Cl
I-627	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	Cl	Cl
I-628	4-三氟甲氧基肉桂基	H	Cl	Cl	Cl
I-629	4-五氟乙氧肉桂基	H	Cl	Cl	Cl
I-630	4-甲氧肉桂基	H	Cl	Cl	Cl
I-631	4-乙氧肉桂基	H	Cl	Cl	Cl
I-632	4-氰基肉桂基	H	Cl	Cl	Cl
I-633	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-634	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	Cl	Cl	Cl
I-635	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-636	3-氯-4-氟-肉桂基	H	Cl	Cl	Cl
I-637	3,5-二氯-肉桂基	H	Cl	Cl	Cl
I-638	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	Cl	Cl	Cl
I-639	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	Cl	Cl	Cl
I-640	3-萘-2-基烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-641	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-642	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-643	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-644	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-645	4-氯苄基	Cl	H	Cl	Cl
I-646	肉桂基	Cl	H	Cl	Cl
I-647	4-氯肉桂基	Cl	H	Cl	Cl
I-648	4-氟肉桂基	Cl	H	Cl	Cl
I-649	4-溴肉桂基	Cl	H	Cl	Cl
I-650	4-三氟甲基肉桂基	Cl	H	Cl	Cl
I-651	4-三氟甲氧基肉桂基	Cl	H	Cl	Cl
I-652	4-五氟乙氧肉桂基	Cl	H	Cl	Cl
I-653	4-甲氧肉桂基	Cl	H	Cl	Cl
I-654	4-乙氧肉桂基	Cl	H	Cl	Cl
I-655	4-氰基肉桂基	Cl	H	Cl	Cl
I-656	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-657	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	Cl	H	Cl	Cl
I-658	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-659	3-氯-4-氟-肉桂基	Cl	H	Cl	Cl
I-660	3,5-二氯-肉桂基	Cl	H	Cl	Cl
I-661	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	H	Cl	Cl
I-662	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	Cl	H	Cl	Cl

[0091]

I-663	3-萘-2-基烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-664	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-665	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-666	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-667	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-668	4-氯苄基	Cl	Cl	H	Cl
I-669	肉桂基	Cl	Cl	H	Cl
I-670	4-氯肉桂基	Cl	Cl	H	Cl
I-671	4-氟肉桂基	Cl	Cl	H	Cl
I-672	4-溴肉桂基	Cl	Cl	H	Cl
I-673	4-三氟甲基肉桂基	Cl	Cl	H	Cl
I-674	4-三氟甲氧基肉桂基	Cl	Cl	H	Cl
I-675	4-五氟乙氧肉桂基	Cl	Cl	H	Cl
I-676	4-甲氧肉桂基	Cl	Cl	H	Cl
I-677	4-乙氧肉桂基	Cl	Cl	H	Cl
I-678	4-氰基肉桂基	Cl	Cl	H	Cl
I-679	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-680	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	Cl	Cl	H	Cl
I-681	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-682	3-氯-4-氟-肉桂基	Cl	Cl	H	Cl
I-683	3,5-二氯-肉桂基	Cl	Cl	H	Cl
I-684	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	Cl	H	Cl
I-685	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	Cl	Cl	H	Cl
I-686	3-萘-2-基烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-687	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-688	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-689	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-690	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-691	4-氯苄基	Cl	Cl	Cl	H
I-692	肉桂基	Cl	Cl	Cl	H
I-693	4-氯肉桂基	Cl	Cl	Cl	H
I-694	4-氟肉桂基	Cl	Cl	Cl	H
I-695	4-溴肉桂基	Cl	Cl	Cl	H
I-696	4-三氟甲基肉桂基	Cl	Cl	Cl	H
I-697	4-三氟甲氧基肉桂基	Cl	Cl	Cl	H
I-698	4-五氟乙氧肉桂基	Cl	Cl	Cl	H
I-699	4-甲氧肉桂基	Cl	Cl	Cl	H
I-700	4-乙氧肉桂基	Cl	Cl	Cl	H
I-701	4-氰基肉桂基	Cl	Cl	Cl	H
I-702	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-703	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	Cl	Cl	Cl	H
I-704	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-705	3-氯-4-氟-肉桂基	Cl	Cl	Cl	H
I-706	3,5-二氯-肉桂基	Cl	Cl	Cl	H
I-707	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	Cl	Cl	H
I-708	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	Cl	Cl	Cl	H
I-709	3-萘-2-基烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-710	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-711	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-712	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	Cl	Cl	H

I-713	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-714	4-氯苄基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-715	肉桂基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-716	4-氯肉桂基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-717	4-氟肉桂基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-718	4-溴肉桂基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-719	4-三氟甲基肉桂基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-720	4-三氟甲氧基肉桂基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-721	4-五氟乙氧肉桂基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-722	4-甲氧肉桂基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-723	4-乙氧肉桂基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-724	4-氰基肉桂基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-725	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-726	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-727	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-728	3-氯-4-氟-肉桂基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-729	3,5-二氯-肉桂基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-730	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-731	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-732	3-萘-2-基烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-733	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-734	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-735	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-736	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-737	4-氯苄基	F	F	F	F
I-738	肉桂基	F	F	F	F
I-739	4-氯肉桂基	F	F	F	F
I-740	4-氟肉桂基	F	F	F	F
I-741	4-溴肉桂基	F	F	F	F
I-742	4-三氟甲基肉桂基	F	F	F	F
I-743	4-三氟甲氧基肉桂基	F	F	F	F
I-744	4-五氟乙氧肉桂基	F	F	F	F
I-745	4-甲氧肉桂基	F	F	F	F
I-746	4-乙氧肉桂基	F	F	F	F
I-747	4-氰基肉桂基	F	F	F	F
I-748	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	F	F	F	F
I-749	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	F	F	F	F
I-750	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	F	F	F	F
I-751	3-氯-4-氟-肉桂基	F	F	F	F
I-752	3,5-二氯-肉桂基	F	F	F	F
I-753	5-苯基-戊-2,4-二烯基	F	F	F	F
I-754	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	F	F	F	F
I-755	3-萘-2-基烯丙基	F	F	F	F
I-756	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	F	F	F
I-757	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	F	F	F	F
I-758	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	F	F	F
I-759	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	F	F	F	F
I-760	4-氯苄基	H	F	H	F
I-761	肉桂基	H	F	H	F
I-762	4-氯肉桂基	H	F	H	F

[0092]

I-763	4- 氟肉桂基	H	F	H	F
I-764	4- 溴肉桂基	H	F	H	F
I-765	4- 三氟甲基肉桂基	H	F	H	F
I-766	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	F	H	F
I-767	4- 五氟乙氧肉桂基	H	F	H	F
I-768	4- 甲氧肉桂基	H	F	H	F
I-769	4- 乙氧肉桂基	H	F	H	F
I-770	4- 氰基肉桂基	H	F	H	F
I-771	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	F	H	F
I-772	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	F	H	F
I-773	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	F	H	F
I-774	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	F	H	F
I-775	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	F	H	F
I-776	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	F	H	F
I-777	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	F	H	F
I-778	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	F	H	F
I-779	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	F	H	F
I-780	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	F	H	F
I-781	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	F	H	F
I-782	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	F	H	F
I-783	4- 氯苄基	H	F	F	H
I-784	肉桂基	H	F	F	H
I-785	4- 氯肉桂基	H	F	F	H
I-786	4- 氟肉桂基	H	F	F	H
I-787	4- 溴肉桂基	H	F	F	H
I-788	4- 三氟甲基肉桂基	H	F	F	H
I-789	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	F	F	H
I-790	4- 五氟乙氧肉桂基	H	F	F	H
I-791	4- 甲氧肉桂基	H	F	F	H
I-792	4- 乙氧肉桂基	H	F	F	H
I-793	4- 氰基肉桂基	H	F	F	H
I-794	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	F	F	H
I-795	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	F	F	H
I-796	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	F	F	H
I-797	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	F	F	H
I-798	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	F	F	H
I-799	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	F	F	H
I-800	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	F	F	H
I-801	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	F	F	H
I-802	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	F	F	H
I-803	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	F	F	H
I-804	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	F	F	H
I-805	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	F	F	H
I-806	4- 氯苄基	H	F	F	H
I-807	肉桂基	H	H	F	F
I-808	4- 氯肉桂基	H	H	F	F
I-809	4- 氟肉桂基	H	H	F	F
I-810	4- 溴肉桂基	H	H	F	F
I-811	4- 三氟甲基肉桂基	H	H	F	F
I-812	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	H	F	F

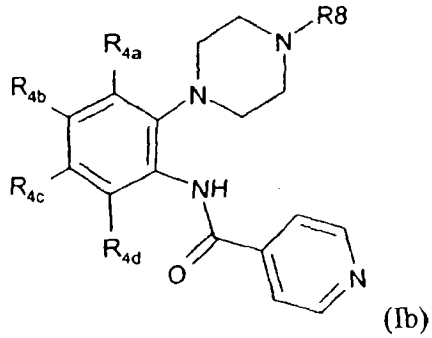
I-813	4- 五氟乙氧肉桂基	H	H	F	F
I-814	4- 甲氧肉桂基	H	H	F	F
I-815	4- 乙氧肉桂基	H	H	F	F
I-816	4- 氰基肉桂基	H	H	F	F
I-817	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	H	F	F
I-818	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	H	F	F
I-819	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	H	F	F
I-820	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	H	F	F
I-821	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	H	F	F
I-822	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	H	F	F
I-823	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	H	F	F
I-824	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	H	F	F
I-825	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	H	F	F
I-826	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	H	F	F
I-827	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	H	F	F
I-828	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	H	F	F
I-829	4- 氯苄基	H	H	Cl	Cl
I-830	肉桂基	H	H	Cl	Cl
I-831	4- 氯肉桂基	H	H	Cl	Cl
I-832	4- 氟肉桂基	H	H	Cl	Cl
I-833	4- 溴肉桂基	H	H	Cl	Cl
I-834	4- 三氟甲基肉桂基	H	H	Cl	Cl
I-835	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	H	Cl	Cl
I-836	4- 五氟乙氧肉桂基	H	H	Cl	Cl
I-837	4- 甲氧肉桂基	H	H	Cl	Cl
I-838	4- 乙氧肉桂基	H	H	Cl	Cl
I-839	4- 氰基肉桂基	H	H	Cl	Cl
I-840	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-841	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	H	Cl	Cl
I-842	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-843	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	H	Cl	Cl
I-844	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	H	Cl	Cl
I-845	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	H	Cl	Cl
I-846	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	H	Cl	Cl
I-847	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-848	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-849	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-850	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-851	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-852	4- 氯苄基	H	Cl	Cl	H
I-853	肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-854	4- 氯肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-855	4- 氟肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-856	4- 溴肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-857	4- 三氟甲基肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-858	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-859	4- 五氟乙氧肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-860	4- 甲氧肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-861	4- 乙氧肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-862	4- 氰基肉桂基	H	Cl	Cl	H

[0093]

I-863	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-864	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	Cl	Cl	H
I-865	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-866	3-氯-4-氟-肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-867	3,5-二氯-肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-868	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	Cl	Cl	H
I-869	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-870	3-萘-2-基烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-871	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-872	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-873	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-874	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-875	4-氯苄基	H	Cl	H	Cl
I-876	肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-877	4-氯肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-878	4-氟肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-879	4-溴肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-880	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-881	4-三氟甲氧基肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-882	4-五氟乙氧肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-883	4-甲氧肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-884	4-乙氧肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-885	4-氰基肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-886	3-(6-氯-吡啶-3-基)-烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-887	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	Cl	H	Cl
I-888	3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-889	3-氯-4-氟-肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-890	3,5-二氯-肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-891	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	Cl	H	Cl
I-892	4-异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-893	3-萘-2-基烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-894	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-895	3-(5-氯-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-896	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-897	3-(2-氯-吡啶-4-基)-烯丙基	H	Cl	H	Cl

[0094] 表 II 中提供了 897 种式 Ib 的化合物

[0095]

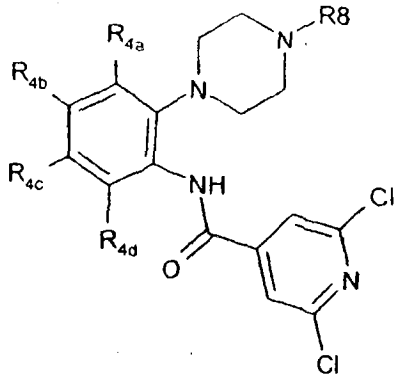


(Ib)

[0096] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0097] 表 III 中提供了 897 种式 Ic 的化合物

[0098]

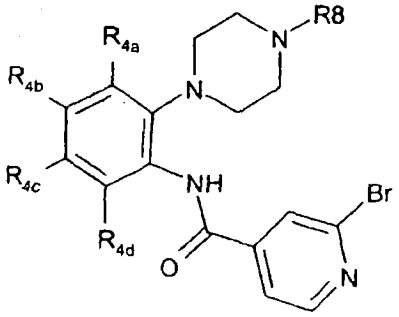


(Ic)

[0099] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0100] 表 IV 中提供了 897 种式 Id 的化合物

[0101]

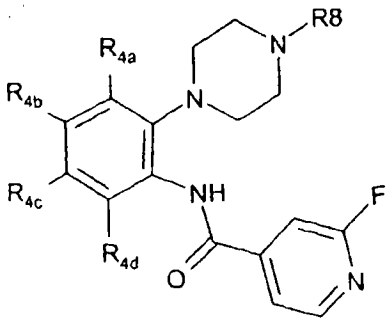


(Id)

[0102] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0103] 表 V 中提供了 897 种式 Ie 的化合物

[0104]

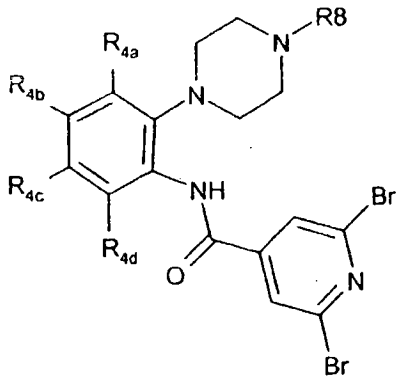


(Ie)

[0105] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0106] 表 VI 中提供了 897 种式 If 的化合物

[0107]

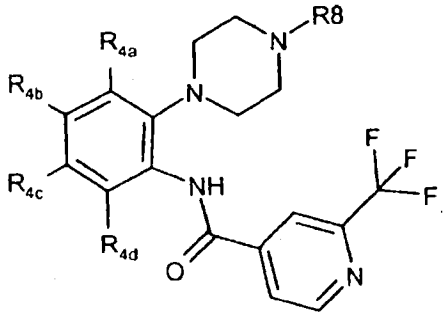


(If)

[0108] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0109] 表 VII 中提供了 897 种式 Ig 的化合物

[0110]

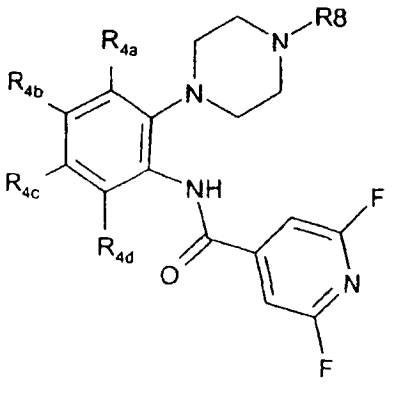


(Ig)

[0111] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0112] 表 VIII 中提供了 897 种式 Ih 的化合物

[0113]

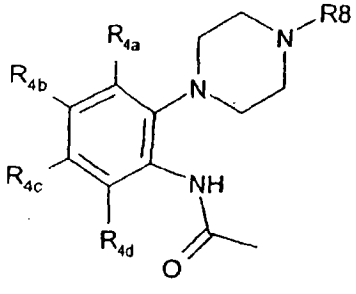


(Ih)

[0114] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0115] 表 IX 中提供了 897 种式 Ii 的化合物

[0116]

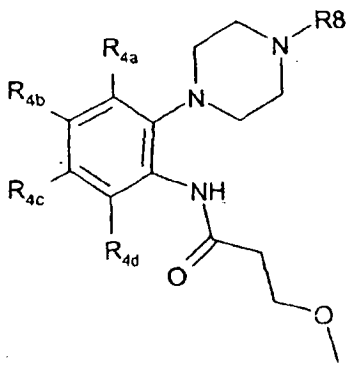


(Ii)

[0117] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0118] 表 X 提供了 897 种式 Ij 的化合物

[0119]

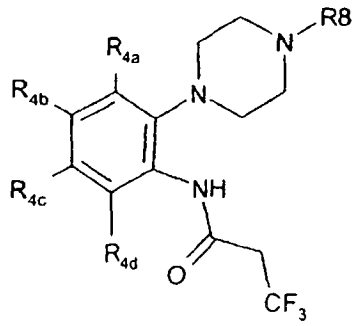


(Ij)

[0120] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0121] 表 XI 提供了 897 种式 Ik 的化合物

[0122]

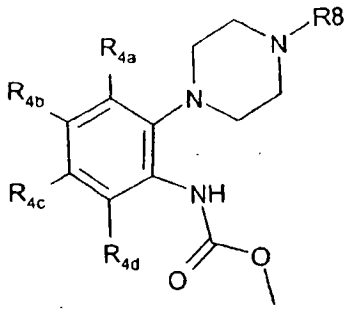


(Ik)

[0123] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0124] 表 XII 提供了 897 种式 Il 的化合物

[0125]

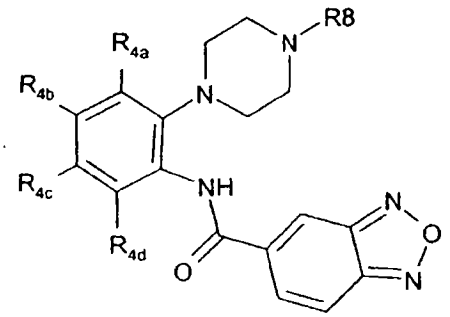


(Il)

[0126] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0127] 表 XIII 提供了 897 种式 Im 的化合物

[0128]

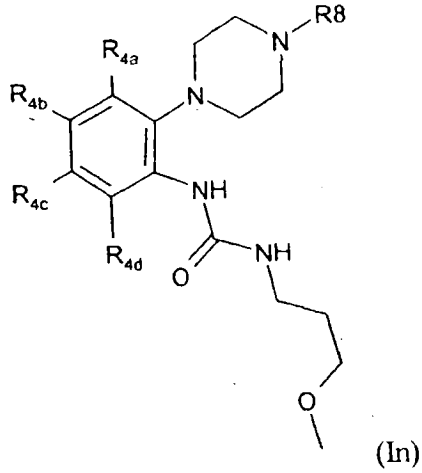


(Im)

[0129] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0130] 表 XIV 提供了 897 种式 In 的化合物

[0131]

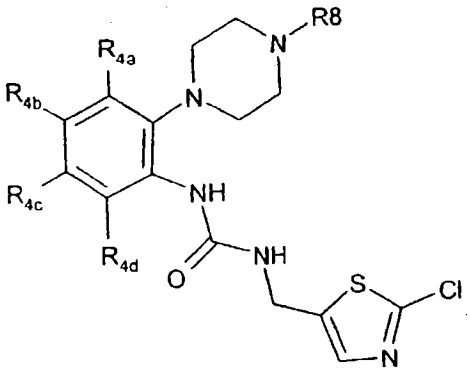


(In)

[0132] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0133] 表 XV 提供了 897 种式 Io 的化合物

[0134]

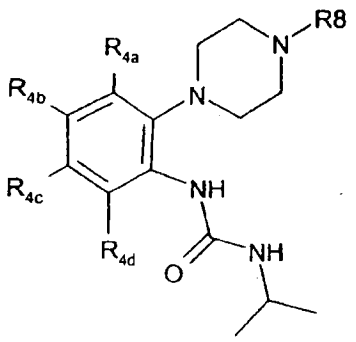


(Io)

[0135] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0136] 表 XVI 提供了 897 种式 Ip 的化合物

[0137]

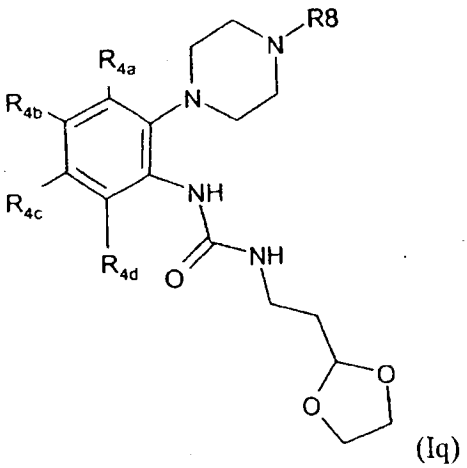


(Ip)

[0138] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0139] 表 XVII 提供了 897 种式 Iq 的化合物

[0140]

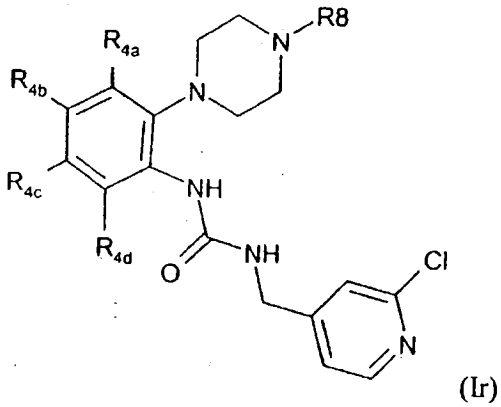


(Iq)

[0141] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0142] 表 XVIII 提供了 897 种式 Ir 的化合物

[0143]

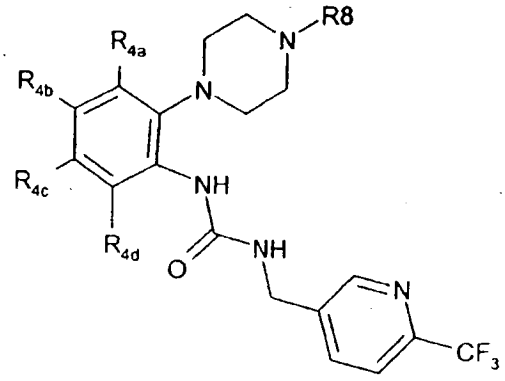


(Ir)

[0144] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0145] 表 XIX 提供了 897 种式 Is 的化合物

[0146]

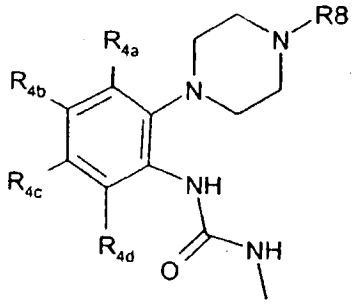


(Is)

[0147] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0148] 表 XX 提供了 897 种式 It 的化合物

[0149]

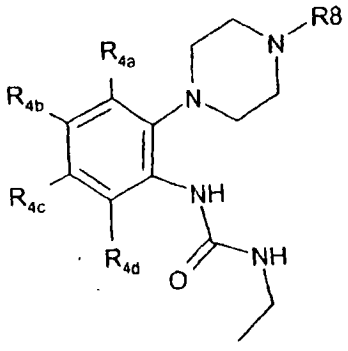


(It)

[0150] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0151] 表 XXI 提供了 897 种式 Iu 的化合物

[0152]

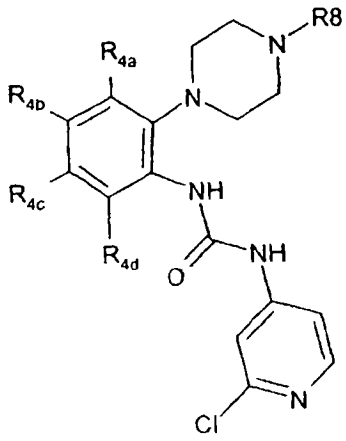


(Iu)

[0153] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0154] 表 XXII 中提供了 897 种式 Iv 的化合物

[0155]

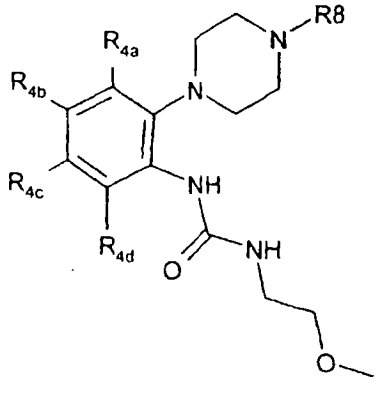


(Iv)

[0156] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0157] 表 XXIII 中提供了 897 种式 Iw 的化合物

[0158]

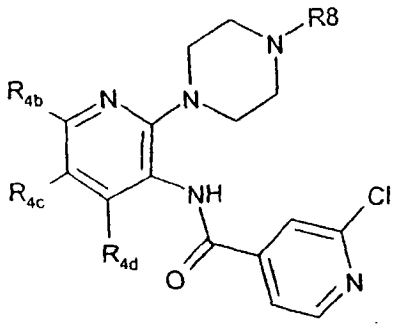


(Iw)

[0159] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0160] 表 XXIV 提供了 110 种式 Ix 的化合物

[0161]



(Ix)

[0162] 其中 R^8、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 24 中所示。

[0163] 表 24

[0164]

化合 物	R^8	R^{4b}	R^{4c}	R^{4d}
XXIV-1	肉桂基	H	H	H
XXIV-2	4- 氯肉桂基	H	H	H
XXIV-3	4- 氟肉桂基	H	H	H
XXIV-4	4- 溴肉桂基	H	H	H
XXIV-5	4- 三氟甲基肉桂基	H	H	H
XXIV-6	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	H	H
XXIV-7	4- 五氟乙氧肉桂基	H	H	H
XXIV-8	4- 甲氧肉桂基	H	H	H
XXIV-9	4- 乙氧肉桂基	H	H	H
XXIV-10	4- 氰基肉桂基	H	H	H
XXIV-11	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	H	H
XXIV-12	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	H	H
XXIV-13	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	H	H
XXIV-14	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	H	H
XXIV-15	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	H	H
XXIV-16	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	H	H
XXIV-17	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	H	H
XXIV-18	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	H	H
XXIV-19	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	H	H
XXIV-20	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	H	H
XXIV-21	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	H	H
XXIV-22	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	H	H
XXIV-23	肉桂基	F	H	H
XXIV-24	4- 氯肉桂基	F	H	H
XXIV-25	4- 氟肉桂基	F	H	H
XXIV-26	4- 溴肉桂基	F	H	H
XXIV-27	4- 三氟甲基肉桂基	F	H	H
XXIV-28	4- 三氟甲氧基肉桂基	F	H	H
XXIV-29	4- 五氟乙氧肉桂基	F	H	H
XXIV-30	4- 甲氧肉桂基	F	H	H
XXIV-31	4- 乙氧肉桂基	F	H	H
XXIV-32	4- 氰基肉桂基	F	H	H
XXIV-33	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	F	H	H
XXIV-34	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	F	H	H
XXIV-35	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	F	H	H
XXIV-36	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	F	H	H
XXIV-37	3,5- 二氯 - 肉桂基	F	H	H
XXIV-38	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	F	H	H
XXIV-39	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	F	H	H
XXIV-40	3- 萘 -2- 基烯丙基	F	H	H
XXIV-41	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	F	H	H
XXIV-42	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	F	H	H
XXIV-43	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	F	H	H
XXIV-44	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	F	H	H
XXIV-45	肉桂基	Cl	H	H
XXIV-46	4- 氯肉桂基	Cl	H	H
XXIV-47	4- 氟肉桂基	Cl	H	H
XXIV-48	4- 溴肉桂基	Cl	H	H
XXIV-49	4- 三氟甲基肉桂基	Cl	H	H
XXIV-50	4- 三氟甲氧基肉桂基	Cl	H	H
XXIV-51	4- 五氟乙氧肉桂基	Cl	H	H

[0165]

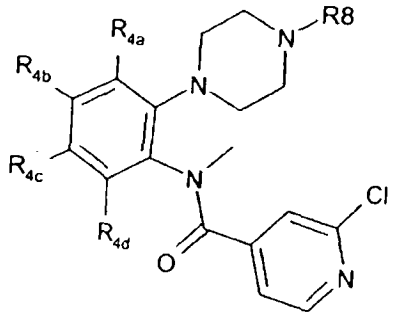
XXIV-52	4- 甲氧肉桂基	Cl	H	H
XXIV-53	4- 乙氧肉桂基	Cl	H	H
XXIV-54	4- 氰基肉桂基	Cl	H	H
XXIV-55	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	Cl	H	H
XXIV-56	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	Cl	H	H
XXIV-57	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	Cl	H	H
XXIV-58	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	Cl	H	H
XXIV-59	3,5- 二氯 - 肉桂基	Cl	H	H
XXIV-60	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	Cl	H	H
XXIV-61	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	Cl	H	H
XXIV-62	3- 萘 -2- 基烯丙基	Cl	H	H
XXIV-63	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	Cl	H	H
XXIV-64	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	Cl	H	H
XXIV-65	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	Cl	H	H
XXIV-66	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	Cl	H	H
XXIV-67	肉桂基	H	F	H
XXIV-68	4- 氯肉桂基	H	F	H
XXIV-69	4- 氟肉桂基	H	F	H
XXIV-70	4- 溴肉桂基	H	F	H
XXIV-71	4- 三氟甲基肉桂基	H	F	H
XXIV-72	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	F	H
XXIV-73	4- 五氟乙氧肉桂基	H	F	H
XXIV-74	4- 甲氧肉桂基	H	F	H
XXIV-75	4- 乙氧肉桂基	H	F	H
XXIV-76	4- 氰基肉桂基	H	F	H
XXIV-77	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	F	H
XXIV-78	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	F	H
XXIV-79	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	F	H
XXIV-80	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	F	H
XXIV-81	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	F	H
XXIV-82	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	F	H
XXIV-83	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	F	H
XXIV-84	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	F	H
XXIV-85	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	F	H
XXIV-86	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	F	H
XXIV-87	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	F	H
XXIV-88	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	F	H
XXIV-89	肉桂基	H	Cl	H
XXIV-90	4- 氯肉桂基	H	Cl	H
XXIV-91	4- 氟肉桂基	H	Cl	H
XXIV-92	4- 溴肉桂基	H	Cl	H
XXIV-93	4- 三氟甲基肉桂基	H	Cl	H
XXIV-94	4- 三氟甲氧基肉桂基	H	Cl	H
XXIV-95	4- 五氟乙氧肉桂基	H	Cl	H
XXIV-96	4- 甲氧肉桂基	H	Cl	H
XXIV-97	4- 乙氧肉桂基	H	Cl	H
XXIV-98	4- 氰基肉桂基	H	Cl	H
XXIV-99	3-(6- 氯 - 吡啶 -3- 基)- 烯丙基	H	Cl	H
XXIV-100	3-(4- 氯苯基)- 丁 -2- 烯基	H	Cl	H
XXIV-101	3-(4- 氯苯基)-3- 氟 - 烯丙基	H	Cl	H
XXIV-102	3- 氯 -4- 氟 - 肉桂基	H	Cl	H

[0166]

XXIV-103	3,5- 二氯 - 肉桂基	H	Cl	H
XXIV-104	5- 苯基 - 戊 -2,4- 二烯基	H	Cl	H
XXIV-105	4- 异丙氧基羰基氨基肉桂基	H	Cl	H
XXIV-106	3- 萘 -2- 基烯丙基	H	Cl	H
XXIV-107	3-(5- 三氟甲基 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	Cl	H
XXIV-108	3-(5- 氯 - 吡啶 -2- 基)- 烯丙基	H	Cl	H
XXIV-109	3- 吡啶 -4- 基 - 烯丙基	H	Cl	H
XXIV-110	3-(2- 氯 - 吡啶 -4- 基)- 烯丙基	H	Cl	H

[0167] 表 XXV 中提供了 897 种式 Iy 的化合物

[0168]



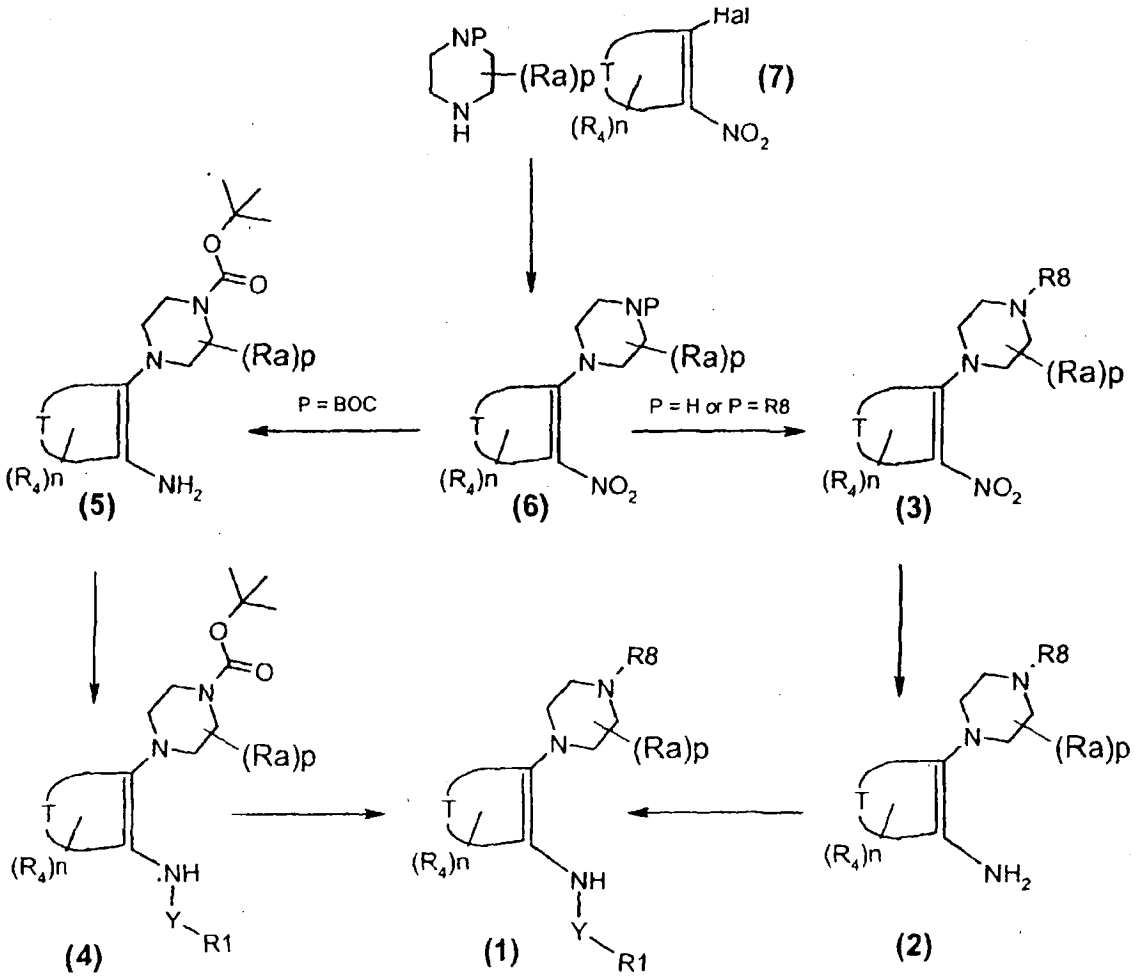
(Iy)

[0169] 其中 R^8、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c} 和 R^{4d} 的定义如表 1 中所示。

[0170] 可通过各种方法制备本发明化合物。例如他们可根据路线 1 的反应来制备。

[0171] 路线 1

[0172]



[0173] 这样式 1 化合物可由合适的吸电子试剂和式 2 化合物反应制得。其中 Y 为羰基的式 1 化合物可通过式 2 化合物与式 R1-C(O)-Z 的羧酸衍生物反应制得，其中 Z 是氯化物、羟基、烷氧基或酰氧基，所述反应是在 0℃至 150℃的温度下、在任选的有机溶剂例如二氯甲烷、氯仿或 1,2- 二氯乙烷中、在任选的叔胺碱例如三乙胺或二异丙基乙胺的存在下和任选的偶联剂例如二环己基碳二亚胺存在下进行的。其中 Y 为羰基和 R1 为式 R′ -NH- 的胺取代基的式 1 化合物可通过式 4 化合物与式 R′ -N = C = O 的异氰酸酯在类似的条件下反应制得。其中 Y 为式 $S(O)_m$ 的式 1 化合物可由式 2 化合物与式 $R1-S(O)_m-Cl$ 的化合物在类似条件下反应制得。其中 Y 为硫羰基和 R1 为式 R′ -NH- 的胺取代基的式 1 化合物可通过式 2 化合物与式 R′ -N = C = S 的异硫氰酸盐在类似的条件下反应制得。

[0174] 或者 Y 为硫代羰基且 R1 为碳取代基的式 1 化合物可通过用合适的硫代硫酸盐试剂例如 Lawesson′ s 试剂处理其中 Y 为羰基且 R1 为碳取 代基的式 1 化合物制得。

[0175] 在上述过程中的式 R1-C(O)-Z 衍生物、式 R′ -N = C = O 的异氰酸酯、式 R′ -N = C = S 的异硫氰酸酯和式 $R1-S(O)_q-Cl$ 的亲电子试剂是已知化合物或可通过本领域技术人员已知的方法由已知化合物制得。

[0176] 式 2 化合物可根据本领域技术人员已知的方法通过还原式 3 化合物的硝基制得。

[0177] 式 3 化合物可通过其中 P 为 H 的式 6 化合物与式 R8-L 的烷基化试剂，其中 L 是氯化物、溴化物、碘化物或磺酸酯（例如甲磺酸酯或甲苯磺酸酯），或类似的离去基团在室温至 100℃，一般为 65℃的温度下，在有机溶剂例如二氯甲烷或 1,2- 二氯乙烷中，在叔胺碱例如三乙胺或二异丙基乙胺的存在下和任选在卤化物盐例如碘化钠、碘化钾或碘化四丁铵的

催化下反应制得。或者，P 为 H 的式 6 化合物可与式 RzCHO 的醛在室温至 100℃的温度下、在有机溶剂例如四氢呋喃或乙醇或混合溶剂中、在还原剂例如硼烷 - 吡啶络合物、硼氢化钠、（三乙酰氧基）硼氢化钠、氰基硼氢化钠或这类类似物的存在下反应制得其中 R8 为 CH_2-Rz 的式 3 化合物。

[0178] 或者，式 1 化合物可由式 4 化合物与酸例如三氟乙酸在室温下、在有机溶剂例如二氯甲烷、氯仿或 1,2- 二氯乙烷中反应，随后用无机碱例如碳酸钠、碳酸氢钠或类似化合物的水溶液中和反应 (1) 混合物；然后与上述烷基化剂或醛反应 (2) 制得。

[0179] 如同上述的由式 2 化合物转化为式 1 化合物的方法，式 4 化合物可通过式 5 化合物与合适的亲电试剂反应制得。

[0180] 式 5 化合物可根据本领域已知的方法通过还原式 6 化合物的硝基制得，其中 P 是叔丁氧羰基。

[0181] 式 6 化合物可通过式 7 化合物与哌嗪 (P = H) 或 N-BOC- 哌嗪 (P = t- 丁氧羰基) 在 0℃ -180℃的温度下，在溶剂例如二氯甲烷、1,2- 二氯乙烷、乙腈、二甲基甲酰胺或二甲亚砜中，在碱例如三乙胺、二异丙基乙胺或碳酸钾或没有碱的存在下反应制得。

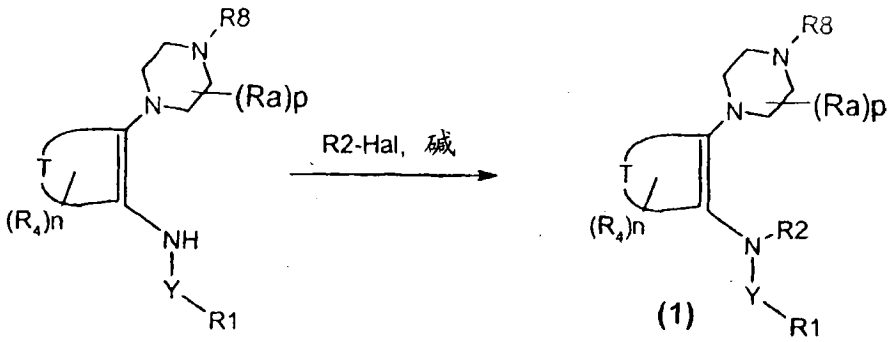
[0182] 式 5、式 6 和式 7 是已知化合物或可通过已知方法由已知化合物 制得。

[0183] 一些式 2、式 3 和式 4 的化合物是新的并因此形成本发明的另一个方面。

[0184] 本领域技术人员应该很容易认识到能够将其中 R2 为 H 的式 1 化合物或路线 1 中的中间体转化成另一种式 I 的化合物。路线 2、3 和 4 中给出了这种转化的例子，其中 R 基团具有上述式 I 化合物所述定义。

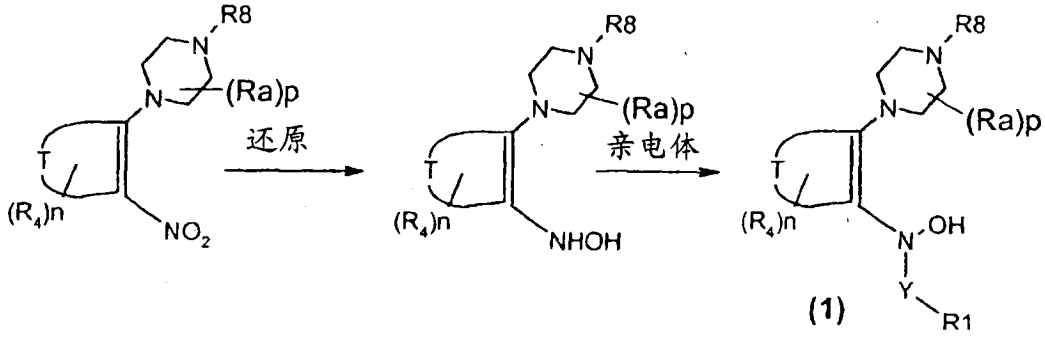
[0185] 路线 2

[0186]



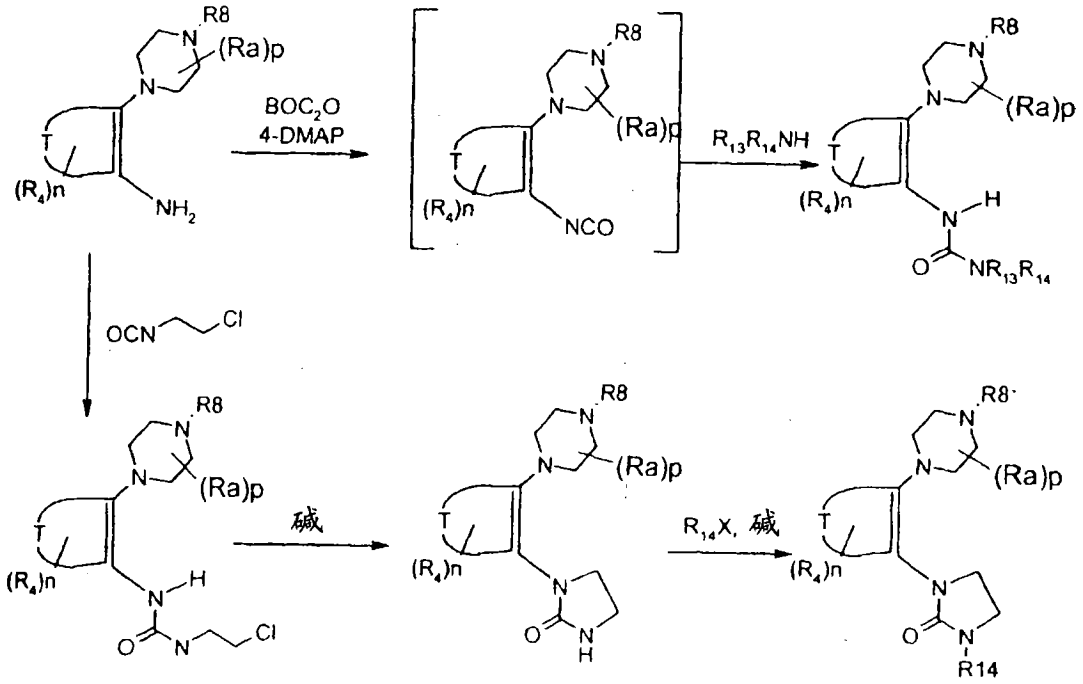
[0187] 路线 3

[0188]



[0189] 路线 4

[0190]



[0191] 式(I)化合物可用于杀灭和防治害虫例如鳞翅目、双翅目、半翅 目、缨翅目、直翅目、网翅目、鞘翅目、蚤目、膜翅目和等翅目以及其它无脊椎害虫例如螨虫、线虫和软体动物害虫的侵害。在下面昆虫、螨虫、线虫和软体动物都被总称为害虫。可使用本发明化合物消灭和防治的害虫包括那些与农业(所述术语包括食用和纤维产品作物种植)、园艺和畜牧业、伴生动物、林业和贮藏植物源产品(例如水果、粮食和木料)相关的害虫;那些与损害人造组织和传播人和动物疾病相关的害虫;以及公害害虫(例如苍蝇)。

[0192] 通过式(I)化合物防治害虫种类的例子包括:桃蚜(Myzuspersicae)、棉蚜(Aphis gossypii)、甜菜蚜(Aphis fabae)、盲蝽属(Lygus spp.)、红蝽属(Dysdercus spp.)、褐飞虱(Nilaparvatalugens)、黑尾叶蝉(Nephotettixc incticeps)、绿蝽属(Nezara spp.)、褐蝽属(Euschistus spp.)、蛛缘蝽属(Leptocorisa spp.)、苜蓿蓟马(Frankliniella occidentalis)、蓟马属(Thrips spp.)、马铃薯叶甲(Leptinotarsa decemlineata)、野棉铃象甲(Anthonomusgrandis)、圆蚧属(Aonidiella spp.)、粉虱(Trialeurodes spp.)、棉粉虱(Bemisia tabaci)、欧洲玉米螟(Ostrinia nubilalis)、贪棉夜蛾(Spodoptera littoralis)、烟草夜蛾(Heliothisvirescens)、棉铃虫(Helicoverpa armigera)、谷实夜蛾(Helicoverpazea)、棉卷叶野螟(Sylepta derogata)、大菜粉蝶(Pieris brassicae)、菜蛾(Plutella xylostella)、地老虎属(Agrotis spp.)、二化螟(Chilo suppressalis)、飞蝗(Locusta migratoria)、Chortiocetesterminifera、叶甲属(Diabrotica spp.)、苹果红蜘蛛(Panonychusulmi)、柑桔红蜘蛛(Panonychus citri)、棉红蜘蛛(Tetranychusurticae)、朱砂叶螨(Tetranychus cinnabarinus)、柑桔锈瘿螨(Phyllocoptruta oleivora)、侧多食跗线螨(Polyphagotarsonemuslatus)、短须螨属(Brevipalpus spp.)、微小牛蜱(Boophilusmicroplus)、变异革蜱(Dermacentor variabilis)、猫栉头蚤(Ctenocephalides felis)、潜蝇属(Liriomyza spp.)、家蝇(Muscadomestica)、埃及伊蚊(Aedes aegypti)、按蚊属(Anopheles spp.)、库蚊属(Culex spp.)、绿蝇属(Lucillia spp.)、德国小蠊(Blattellagermanica)、美洲大蠊(Periplaneta americana)、东方蜚蠊(Blattaorientalis)、下列各科白蚁:澳白蚁科

(例如 Mastotermes spp.)、木白蚁科(例如 Neotermes spp.)、犀白蚁科(例如家白蚁(Coptotermesformosanus);黄枝散白蚁属(Reticulitermes flavipes)、黄胸散白蚁属(R.speratu)、南方散白蚁(R.virginicus)、美国散白蚁(R.hesperus)和 R.santonensis 以及白蚁科(例如黄球白蚁(Globitermes sulphureus))、Solenopsis geminata(火蚁)、厨蚁(Monomorium pharaonis)、啮虱属(Damalinia spp.)和长颚虱属(Linognathus spp.)、根结线虫属(Meloidogyne spp.)、球异皮线虫属(Globodera spp.)和异皮线虫属(Heterodera spp.)、草地垫刃线虫属(Pratylenchus spp.)、香蕉洞线虫(Rhodopholus spp.)、垫刀线虫属(Tylenchulus spp.)、捻转血矛线虫(Haemonchuscontortus)、秀丽隐杆线虫(Caenorhabditis elegans)、毛圆线虫属(Trichostrongylus spp.)和庭园灰蛞蝓(Deroceras reticulatum)。

[0193] 本发明因此还提供一种杀灭和防治昆虫、螨虫、线虫或软体动物的方法,其包括对害虫、害虫的栖息地或易受害虫侵害的植物施用杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物有效量的式(I)化合物或含式(I)化合物的组合物,优选式(I)化合物用于抗昆虫、螨虫或线虫。

[0194] 这里所使用的术语“植物”包括秧苗、灌木和树木。

[0195] 为了对害虫、害虫栖息地或易于受害虫侵害的植物施用作为杀虫剂、杀螨剂、杀线虫剂或杀软体动物剂的式(I)化合物,通常将式(I)化合物配制成组合物形式,该组合物除含式(I)化合物之外,还含有合适的惰性稀释剂或载体和任选的表面活性剂(SFA)。SFA 是能通过降低界面张力改善界面(例如液体/固体、液体/空气或液体/液体界面)性质并因此导致其它性质(例如分散性、乳化性和湿润性)发生改变的化学物质。优选所有组合物(包括固体和液体制剂)都包含 0.0001-95%重量、更优选 1-85%重量,例如 5-60%重量的式(I)化合物。本发明组合物通常以每公顷施用 0.1g-10kg,优选每公顷 1g-6kg, 更优选每公顷 1g-1kg 的式(1)化合物的方式用于防治害虫。

[0196] 当用于拌种时,式(I)化合物的用量为每千克种子 0.0001g-10g(例如 0.001g 或 0.05g),优选 0.005g-10g,更优选 0.005g-4g。

[0197] 另一方面本发明提供一种杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物的组合物,其含有有效量的杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物的式(I)化合物和合适的载体或稀释剂。所述组合物优选是杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物的组合物。

[0198] 再一方面,本发明提供了一种在栖息地杀灭和防治害虫的方法,该方法包括用杀昆虫、杀螨、杀线虫或杀软体动物有效量的包含式(I)化合物的组合物处理害虫或害虫栖息地。式(I)化合物优选用于抗昆虫、螨虫或线虫。

[0199] 本发明组合物可以选自多种制剂类型,包括可喷粉粉剂(DP)、可溶性粉剂(SP)、水溶性颗粒剂(SG)、水分散颗粒剂(WG)、可湿性粉剂(WP)、颗粒剂(GR)(缓慢或快速释放)、可溶性浓缩物(SL)、油混溶性液剂(OL)、超低量液剂(UL)、浓缩乳剂(EC)、可分散浓缩物(DC)、乳剂(包括水包油型(EW)和油包水型(EO))、微乳剂(ME)、悬浮剂(SC)、气雾剂、成雾剂/烟剂、胶囊悬浮剂(CS)和种子处理剂型。在任情况下剂型类型的选择均取决于所预想的具体目的和本发明式(I)化合物的物理、化学以及生物学性质。

[0200] 可如下制备可喷粉粉剂(DP):将式(I)化合物与一种或多种固体稀释剂(例如天然粘土,高岭土,叶蜡石,膨润土,矾土,蒙脱石,硅藻石,碳酸钙,硅藻土,磷酸钙,磷酸钙和磷酸镁,硫磺,石灰,面粉,滑石及其它有机的和无机的固体载体)混和,并将此混合物机械

研磨成细粉末。

[0201] 可如下制备可溶性粉剂(SP):将式(I)化合物与一种或多种水溶性无机盐(如碳酸氢钠、碳酸钠或硫酸镁)或一种或多种水溶性有机固体(例如多醣)、以及一种或多种任选的用于改善水分散性/溶解性的润湿剂、一种或多种分散剂或所述物质的混合物相混和。然后将此混合物研磨成细粉末。类似的组合物也可以颗粒化以形成水溶性颗 粒剂(SG)。

[0202] 可湿性粉剂(WP)可通过将式(I)化合物与一种或多种固体稀释剂料或载体、一种或多种润湿剂、和优选一种或多种分散剂以及任选的一种或多种用于促进液体分散的悬浮剂相混和来制备。然后将此混合物研磨成细粉末。类似地也可以颗粒化组合物以形成水分散颗粒剂(WG)。

[0203] 颗粒剂(GR)可通过如下方法形成:颗粒化式(I)化合物和一种或多种粉状固体稀释剂或载体的混合物,或利用预先形成的空白颗粒剂在多孔颗粒物质(如浮石、山软木土、漂白土、硅藻石、硅藻土或玉米穗轴粉)中吸收式(I)化合物(或其在适宜试剂中的溶液),或将式(I)化合物(或其在适宜试剂中的溶液)吸附到硬核物质(如砂子,硅酸盐,矿物质碳酸盐,硫酸盐或者磷酸酯)上来制备,如有必要,再加以干燥。通常用于助吸收或吸附的试剂包括溶剂(例如脂肪族的和芳香族的石油类溶剂、醇、醚、酮和酯)和粘着剂(例如聚醋酸乙烯酯、聚乙烯醇、糊精、糖和植物油)。颗粒剂中也可包括一种或多种其它的添加剂(例如乳化剂、润湿剂或分散剂)。

[0204] 可分散浓缩物(DC)可通过在水中或有机溶剂如酮、醇类或乙二醇醚中溶解式(I)化合物来制备。这些溶液中可含有表面活性剂(例如用于改善水稀释性或防止在喷洒器中结晶)。

[0205] 浓缩乳剂(EC)或水包油乳化剂(EW)可通过在有机溶剂(任选的包含一种或多种润湿剂、一种或多种乳化剂或所述物质的混合物)中溶解式(I)化合物来制备。EC中所用的合适有机溶剂包括芳香烃(如烷基苯或烷基萘,其实例有SOLVESSO100、SOLVESSO150和SOLVESSO200;SOLVESSO是注册商标)、酮(如环己酮或甲基环己酮)、醇类(如苯甲醇、糠醇或丁醇)、N-烷基吡咯烷酮(如N-甲基吡咯烷酮或N-辛基吡咯烷酮)、脂肪酸的二甲基酰胺(如C_8-C_{10}脂肪酸二甲基酰胺)和氯代烃。EC产物加水可自然乳化,生成具有足够稳定性的乳化液,从而可通过适当的设备进行喷洒施肥。EW的制备包括获得液体形式(如果在室温下不是液体,其可在适当的温度下融化,一般温 度低于70℃)或溶液形式(通过在适当的溶剂中溶解所得)的式(I)化合物,然后在高剪切刀下将生成的液体或溶液在含有一种或多种SFA的水中乳化,从而制备得到乳化液。EW中使用的合适溶剂包括植物油、氯代烃(如氯苯)、芳香族溶剂(如烷基苯或烷基萘)和其它适当的在水中具有低溶解度的有机溶剂。

[0206] 微乳剂(ME)可通过将水与一种或多种溶剂和一种或多种SFA的混合物混合来制备,从而自发地生成热力学稳定的均质液体制剂。式(I)化合物开始存在于水中或溶剂/SFA的混合物中。在ME中使用的合适溶剂包括上面所描述的在EC或EW中使用的那些溶剂。ME可以是水包油或者油包水体系(这种体系可通过电导率测量来测定),并且适于与同一制剂中的水溶性和油溶性杀虫剂相混和。ME适于在水中稀释,稀释后仍然可保持为微乳剂或形成常规的水包油乳剂。

[0207] 悬浮剂(SC)可包括式(I)化合物不溶性细碎固体颗粒的水性或非水性悬浮剂。SC的制备包括用球磨或珠磨研磨在合适介质中的式(I)化合物来制备，任选具有一种或多种分散剂，从而制得所述化合物的颗粒悬浮剂。此类组合物中可以包含一种或多种润湿剂和用于降低颗粒下沉速率的悬浮剂。或者，可将式(I)进行干燥研磨并将其添加到含上述物质的水中，从而制备得到所需的最终产物。

[0208] 气雾剂包含式(I)化合物和合适挥发剂(例如正丁烷)。还可将式(I)化合物溶解或分散在合适介质(例如水或水乳液，如正丙醇)中从而形成供在非压、手动喷洒泵中使用的组合物。

[0209] 式(1)化合物可在干燥状态下与烟火混合物相混和以形成适于在封闭场所产生含所述化合物烟雾的组合物。

[0210] 胶囊悬浮剂(CS)可以类似于制备EW剂型的方式制备，但还包括附加的聚合步骤，从而获得油珠的水分散体，其中每滴油珠是被聚合壳密闭，并且包含式(I)的化合物和任选的载体或稀释剂。所述聚合壳可通过界面缩聚反应或者凝聚过程来制备。所述组合物可提供式(I)化合物的控制释放，它们可用于种子处理。式(I)化合物也可以用生物降解聚合物基体来配制，从而形成化合物的缓慢、控制释放。

[0211] 组合物可含有用于改善所述组合物的一种或多种添加剂(例如通过改善湿润性、表面保持性或分配性；处理表面的耐雨性；或式(I)化合物的吸收性或流动性)。这类添加剂包括表面活性剂，油基雾化添加剂，例如某些矿物油或天然植物油(如黄豆和菜籽油)，以及它们和其它生物增强助剂(能增强或改善式(I)化合物的作用效果)的混合物。

[0212] 式(I)化合物还可用于配制成拌种剂，例如配制成粉剂组合物，包括用于干种子处理(DS)的粉剂、水溶性粉剂(SS)或用于浆液处理(WS)的可湿性粉剂，或配制成液体组合物，包括流动的浓缩物(FS)、溶液(LS)或胶囊悬浮剂(CS)。DS、SS、WS、FS、和LS组合物的制备分别与上面所描述的DP、SP、WP、SC和DC组合物的那些制备很相似。用于处理种子的组合物可包含有助于组合物对种子粘附的物质(例如矿物油或成膜防护物)。

[0213] 润湿剂、分散剂和乳化剂可以是阳离子、阴离子、两性或非离子型的表面SFA。

[0214] 合适的阳离子型SFA包括季铵化合物(例如溴化十六烷基三甲铵)、咪唑啉以及胺盐。

[0215] 合适的阴离子SFA包括脂肪酸碱金属盐，硫酸脂肪族单酯的盐(例如十二烷基硫酸钠)，磺化芳族化合物的盐(例如十二烷基苯磺酸钠、十二烷基苯磺酸钙、丁基萘磺酸盐以及二异丙基-和三异丙基-萘磺酸钠的混合物)，醚硫酸盐，醇醚硫酸盐(例如月桂醚-3-硫酸钠)，醚羧酸盐(例如月桂醚-3-羧酸钠)，磷酸酯(一种或多种脂肪醇和磷酸的反应产物(主要是单酯)或与磷酸酐的反应产物(主要是双酯类)，例如月桂醇和四磷酸的反应产物；另外这些也可以被乙氧基化)，磺基琥珀酰胺酸盐，石蜡或链烯烃磺酸盐，牛磺酸盐和木质素磺酸盐。

[0216] 适宜的两性型SFA包括甜菜碱、丙酸盐和甘氨酸盐。

[0217] 适宜的非离子型SFA包括烯基氧化物(如环氧乙烷、氧化丙烯、氧化丁烯或其混合物)与脂肪醇(如油醇或十六烷醇)或烷基酚(如辛基酚、壬基酚或辛基甲酚)的缩合物；衍生于长链脂肪酸或已糖醇 酸酐的偏酯；所述偏酯与环氧乙烷的缩合物；嵌段聚合体(包括环氧乙烷和氧化丙烯)；链烷醇酰胺；单一的酯(例如脂肪酸聚乙二醇酯)；氧化胺(例

如十二烷基二甲氧化胺）;和卵磷脂。

[0218] 适宜的悬浮剂包括亲水胶体（如聚糖、聚乙烯吡咯烷酮或羧甲基纤维素钠）和膨胀粘土（如膨润土或硅镁土）。

[0219] 式（I）化合物可以通过任何已知的施用杀虫化合物的方法来施用。例如，它可以以已配制的或未配制的形式直接施用于害虫或害虫栖息地（例如害虫栖所，或易受害虫侵害的生长植物）或植物的任一部分，包括叶、茎、枝或根，在播种之前施用于种子或者施用于植物生长或即将生长的其它介质（如叶部周围的土壤、普通土壤、水稻田的水或水耕法栽培系统），或可以喷射、涂粉、浸渍施用，以乳膏或糊状制剂来施用，以蒸气的方式施用或通过在土壤或水环境中分布或掺入组合物（如颗粒状组合物或以水溶性囊包裹的组合物）的方式施用。

[0220] 也可以将式（I）化合物注入植物中或用电动喷洒技术或其它低容量方法喷洒在植被上，或通过陆上或空中灌溉系统施用。

[0221] 用作水相制剂（水溶液或分散体）的组合物通常以含高比例活性成分的浓缩物形式施用，浓缩物在使用以前加水稀释。这些浓缩物，包括 DC、SC、EC、EW、ME、SG、SP、WP、WG 和 CS，经常需要经受长期储存，并且经过这种储存之后，加水能形成水剂，该水剂在足够的时间内可保持均匀性，从而使它们能以常规喷洒设备施用。依据它们使用的目的，这种水剂可以含有不同量的式（I）化合物（例如 0.0001-10％重量）。

[0222] 式（I）化合物可与肥料（例如含氮、钾、或磷肥料）混和使用。适宜的剂型包括肥料颗粒剂。混合物适当地包括至多 25％重量的式（I）化合物。

[0223] 因此本发明还提供一种包含肥料和式（I）化合物的肥料组合物。

[0224] 本发明组合物可包括其它具有生物活性的化合物，例如具有杀菌活性或植物生长调节活性、除草、杀虫、杀线虫或杀螨活性的微量元素或化合物。

[0225] 式（I）化合物可以是组合物中的单一活性成分或者它也可是与一种或多种附加的活性成分（如杀虫剂、杀真菌剂、增效剂、除草剂或植物生长调节剂）混和的。附加活性成分可以是：提供具有更广谱活性或在使用场所持续性增强的组合物；增效或补充（例如通过增加作用速度或克服排斥性）式（I）化合物的活性；或帮助克服或预防对单一组分的抗性。具体的附加活性成分依赖于组合物的预想应用。合适的杀虫剂的例子包括：

[0226] a）拟除虫菊酯类，例如氯菊酯、氯氰菊酯、氰戊菊酯、亚尔发菊酯、溴氢菊酯、三氟氯氰菊酯（尤其是 λ-三氟氯氰菊酯）、联苯菊酯、杀螨菊酯、氟氯氰菊酯、七氟菊酯、对鱼安全的拟除虫菊酯（例如苄醚菊酯）、天然除虫菊酯、胺菊酯、S-生物丙烯菊酯、五氟苯菊酯、炔酮菊酯或 5-苄基-3-呋喃基甲-(E)-(1R,3S)-2,2-二甲基-3-(2-氧硫杂戊环-3-亚基甲基）环丙烷羧酸酯；

[0227] b）有机磷酸盐，例如丙溴磷、虫螨消、乙酰甲胺磷、甲基对硫磷、保棉磷、异吸硫磷 II、庚烯磷、二甲硫吸磷、克线磷、久效磷、丙溴磷、三唑磷、甲胺磷、乐果、磷胺、马拉硫磷、毒死蜱、伏杀磷、特丁甲拌磷、丰索磷、地虫磷、甲拌磷、辛硫磷、甲基嘧啶磷、乙基嘧啶磷、杀螟硫磷、噻唑磷或二嗪磷；

[0228] c）氨基甲酸酯（包括芳基氨基甲酸酯），例如抗蚜威、唑蚜威、除线威、克百威、呋线威、乙硫苯威、涕灭威、thiofurox、丁硫克百威、虫威、仲丁威、残杀威、灭多威或去线威；

[0229] d）苯甲酰脲，例如除虫脲、杀铃脲、氟铃脲、氟虫脲或定虫隆；

[0230] e) 有机锡化合物，例如三环锡、六苯丁锡氧或三唑锡；

[0231] f) 吡唑类，例如吡螨胺和唑螨酯；

[0232] g) 大环内酯，例如阿维菌素或密比霉素 (milbemycins)，例如阿巴美丁、埃玛美丁、苯甲酸酯、伊维菌素、密比霉素、多杀菌素或印苦楝子素；

[0233] h) 激素或信息激素；

[0234] i) 有机氯化合物，例如硫丹、六六六、DDT、氯丹或狄氏剂；

[0235] j) 脒类，例如杀虫脒或双甲脒；

[0236] k) 熏蒸剂，例如氯化苦、二氯丙烷、溴甲烷或威百亩；

[0237] l) 氯烟碱基化合物，例如吡虫啉、噻虫啉、啶虫脒、烯啶虫胺或噻虫嗪；

[0238] m) 二酰基肼类，例如虫酰肼、环虫酰肼或甲氧虫酰肼；

[0239] n) 二苯醚类，例如苯虫醚或吡丙醚；

[0240] o) 茚虫威；

[0241] p) 溴虫腈；或

[0242] q) 吡蚜酮。

[0243] 除上面所列的主要化学杀虫剂类型之外，如果适于组合物应用的需要，还可在组合物中使用具有特定目的的其它杀虫剂。例如，可以使用适用特定作物的选择性杀虫剂，例如可在水稻中使用钻心虫特异性杀虫剂（例如杀螟丹）或飞虱特异性杀虫剂（例如稻虱净）。或者组合物中也可包括针对特定昆虫类 / 阶段的特定杀虫剂或杀螨剂（例如杀螨的卵 - 幼虫剂，例如四螨嗪、氟螨隆、噻螨酮或三氯杀螨砜；杀螨游动剂 (acaricidal motilicides)，例如三氯杀螨醇或克螨特；杀螨剂，例如溴螨酯或乙酯杀螨醇；或植物生长调节剂，例如伏蚁腙、灭蝇胺、烯虫酯、定虫隆或除虫脲）。

[0244] 可包含在本发明组合物中的杀菌剂化合物的例子包括 (E)-N- 甲基 -2-[2-(2,5- 二甲基苯氧基甲基）苯基]-2- 甲氧基亚氨基乙酰胺 (SSF-129)，4- 溴 -2- 氰基 -N,N- 二甲基 -6- 三氟甲基苯并咪唑 -1- 磺酰胺，α -[N-(3- 氯 -2,6- 二甲苯基)-2- 甲氧基乙酰氨基]- γ - 丁内酯，4- 氯 -2- 氰基 -N,N- 二甲基 -5-p- 甲苯基咪唑 -1- 磺酰胺 (IKF-916，cyamidazosulfamid)，3-5- 二氯 -N-(3- 氯 -1- 乙基 -1- 甲基 -2- 氧丙基)-4- 甲基苯甲酰胺 (RH-7281，zoxamide)，N- 烯丙基 -4,5- 二甲基 -2- 三甲硅烷基噻吩 -3- 甲酰胺 (MON65500)，N-(1- 氰基 -1,2- 二甲基丙基)-2-(2,4- 二氯苯氧基）丙酰胺 (AC382042)，N-(2- 甲氧基 -5- 吡啶基)- 环丙烷甲酰胺，活化酯 (CGA245704)，棉铃威，aldimorph，敌菌灵，氧环唑，嘧菌酯，苯霜灵，苯菌灵，双苯三唑醇双苯三唑醇， 稻瘟散，糠菌唑，磺酸丁嘧啶，敌菌丹，克菌丹，多菌灵，多菌灵，多菌灵盐酸盐、萎锈灵，环丙酰胺，香芹酮，CGA41396，CGA41397，灭螨猛，百菌清，乙菌利，clozylacon，含铜化合物例如王铜、喹啉铜、硫酸铜、树脂酸铜和波尔多液，霜脲氰，环唑醇，嘧菌环胺，咪菌威，二 -2- 吡啶基二硫化物 1,1′ - 二氧化物，抑菌灵，哒菌清，氯硝铵，乙霉威，噁醚唑，双苯唑快，氟嘧菌胺，0，0- 二 - 异丙基 -S- 苄基硫代磷酸酯，dimefluazole，dimetconazole，烯酰吗啉，甲菌定，烯唑醇，敌螨普，二噻农，十二烷基二甲氯化铵，吗菌灵，多吗菌灵，doguadine，克瘟散，环氧菌唑，乙菌定，(Z)-N- 苄基 -N-([甲基 (甲硫基亚乙基氨基氧羰基) 氨基] 硫)-β - 丙氨酸乙酯，土菌灵，噁唑菌酮，咪唑菌酮 (RPA407213)，氯苯嘧啶醇，唑菌腈，甲呋酰苯胺，环酰菌胺 (KBR2738)，拌种咯，苯锈啶，粉锈啉，薯瘟锡，毒菌锡，福美铁，嘧菌腙，氟啶胺，氟咯菌腈，氟酰菌胺，氟亚胺，氟喹唑，氟硅唑，

氟酰胺，粉唑醇，灭菌丹，麦穗宁，呋霜灵，呋吡菌胺，双胍盐、已唑醇、羟基异噁唑、噁霉灵，抑霉唑、亚胺唑，双胍辛，双胍辛三乙酸盐，种菌唑，异稻瘟净，异菌脲，异丙菌胺 (SZX0722)，氨基甲酸异丙基丁酯，稻瘟灵，春雷霉素，醚菌酯，LY186054，LY211795，LY248908，代森锰锌，代森锰，mefenoxam，嘧菌胺，灭锈胺，甲霜灵，羟菌唑，代森联，代森联锌，苯氧菌胺，腈菌唑，甲基肿酸铁铵，二甲基二硫代氨基甲酸镍，间硝酞异丙酯，氟嘧醇，甲呋酰胺，有机汞化合物，噁酰胺，环氧嘧磺隆，喹菌酮，噁咪唑，氧化萎锈灵，稻瘟酯，戊菌唑，纹枯脲，叶枯净，三乙膦酸铝，磷酸化合物，苯酞，picoxystrobin(ZA1963)，多氧霉素 D，代森联，噻菌灵，丙氯咪，二甲菌核利，霜霉威，丙环唑，甲基代森锌，丙酸，吡菌磷，啶斑肟，甲基嘧菌胺，咯喹酮，氯吡呋醚，硝吡咯菌素，季铵化合物，灭螨猛，苯氧喹啉，五氯硝基苯，氟硅唑 (F-155)，五氯酚钠，螺环菌胺，链霉素，硫磺，戊唑醇，叶枯酞，四氯硝基苯，氟醚唑，噻菌灵，thifluzamid，2-(硫代氰基甲硫基）苯并噻唑，福美双，timibenconazole，甲基立枯磷，对甲抑菌灵，三唑酮，三唑醇， triazbutil，咪唑嗪，三环唑，克啉菌，肟菌酯 (CGA279202)，嗪氨灵，氟菌唑，灭菌唑，有效霉素 A，威百亩，乙烯菌核利，代森锌和福美锌。

[0245] 式 (I) 化合物可与土壤、泥灰或其它根部介质混和，用以保护植物免受源自种子、土壤或叶子的真菌病害。

[0246] 在组合物中使用的合适增效剂的例子包括增效醚、增效散、丙基增效散和十二烷基咪唑。

[0247] 组合物中包括的合适除草剂和植物生长调节剂取决于预定目标和所需效果。

[0248] 可包含的水稻选择性除草剂的例子是敌稗。棉花中使用的植物生长调节剂的例子是 PIX™。

[0249] 某些混合物可包含显著不同的物理、化学或生物学性质的活性成分，因此它们本身难以形成同一种常规剂型。在这些情形下可制备成其它的剂型。例如，当一种活性成分是水不溶性固体而另一种活性成分是水不溶性的液体时，可通过将固体活性成分分散成悬浮液（采用类似于 SC 的制备方法）而将液体活性成分分散成乳化液（采用类似于 EW 的制备方法），从而可以将每种活性成分分散在同一连续水相中。所得组合物是悬浮乳状液 (SE) 制剂。

[0250] 本发明通过下列实施例加以说明：

[0251] 采用下列参数来获得下列实施例所选化合物的质谱数据：

[0252] LCMS：LC5：254nm- 梯度 10％ A 至 100％ B

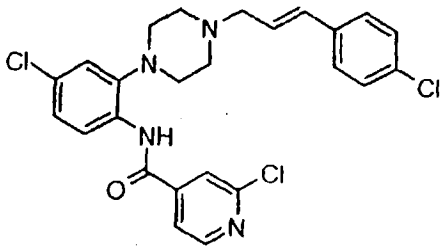
[0253] A ＝ H_2O+0.01％ HCOOH

[0254] B ＝ CH_3CN/CH_3OH+0.01％ HCOOH 正电喷射 150-1000m/z。

[0255] 实施例 1

[0256] 本实施例说明了 2- 氯 -N-(4- 氯 -2-{4-[(E)-3-(4- 氯苯基）- 烯丙基]- 哌嗪 -1- 基 }- 苯基）- 异烟酰胺的制备。

[0257]



[0258] 步骤 A：在 N_2 流下将三乙胺 (4.2ml) 加入到搅拌的 2,4- 二氯硝基苯 (1.9g) 和 1- 叔丁氧羰基 - 哌嗪 (2.2g) 的二甲亚砜 (18ml) 溶液中。将所得溶液在 70℃下搅拌 48 小时，然后冷却至室温。往其中加水并用乙酸乙酯萃取混合物三次；用硫酸钠干燥合并的有机层并真空浓缩。硅胶色谱法处理所得残余物 (环己烷：乙酸乙酯＝ 8 ： 2) 得到 4-(5- 氯 -2- 硝基苯基)- 哌嗪 -1- 甲酸特丁基酯 (2.6g)，为泡沫状物。^{1}H NMR(400MHz, $CDCl_3$) 1.5(s,9H),2.9(brs,4H),3.5(brs,4H),6.9(d, J ＝ 10Hz,1H),7.0(s,1H),7.7.(d, J ＝ 10Hz,1H)；MS(ES+)242/244(M+H$^+$-CO_2- 异丁烯),286/288(M+H$^+$- 异丁烯)。

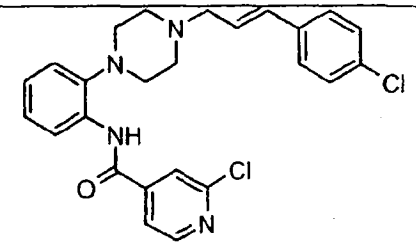
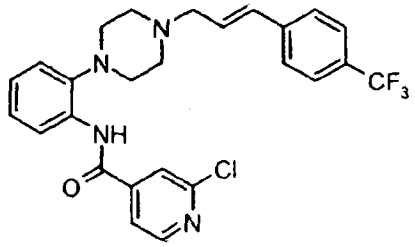
[0259] 步骤 B：在 60℃下往搅拌的步骤 A 所获得化合物 (2.5g) 的乙醇 (40ml) 和水 (30ml) 的悬浮液中加入连二亚硫酸钠 (7.6g)。将所得混合物在 60℃搅拌 1 小时，然后在真空下脱去乙醇。用乙酸乙酯萃取悬浮液三次，用硫酸钠干燥合并的有机层并真空浓缩。硅胶色谱法处理所得残余物 (环己烷：乙酸乙酯＝ 1 ： 1) 得到 4-(2- 氨基 -5- 氯苯基)- 哌嗪 -1- 甲酸特丁基酯 (1.0g)，为白色晶体。M.p.125-127℃；^{1}HNMR(400MHz, $CDCl_3$) 1.5(s, 9H),2.8(m,4H),3.5(m,4H),3.9(s,2H),6.6(d,J ＝ 10Hz,1H),6.8(d,J ＝ 10Hz,1H),6.9(s, 1H)；MS(ES+)212/214(M+H$^+$-CO_2- 异丁烯),256/258(M+H$^+$- 异丁烯),312/314(M+H$^+$)。

[0260] 步骤 C：往搅拌的步骤 B 所获得化合物 (1.0g) 的二氯甲烷 (20ml) 溶液中加入三乙胺 (2ml)；将溶液冷却到 0℃并加入 2- 氯异烟酰氯 (1.2g)。将所得混合物在室温下搅拌 12 小时，然后倒入水中，用二氯甲烷萃取两次，用硫酸钠干燥合并的有机层并真空浓缩。用硅胶色谱法处理残余物 (环己烷：乙酸乙酯＝ 7 ： 2) 获得 4-{5- 氯 -2-[(2- 氯吡啶 -4- 羰基)- 氨基]- 苯基 }- 哌嗪 -1- 甲酸特丁基酯，用正己烷 / 乙酸乙 酯结晶得到白色晶体 (845mg)。M.p.185-189℃；^{1}H NMR(400MHz, $CDCl_3$) 1.5(s,9H),2.9(m,4H),3.7(m,4H),7.2(d, J ＝ 1.5Hz,1H),7.2(dd,J ＝ 1.5,10Hz,1H),7.6(d,J ＝ 5.5Hz,1H),7.8(s,1H),8.5(d,J ＝ 10Hz,1H),8.63(d, J ＝ 5.5Hz,1H),9.4(s,1H, NH)；MS(ES+)351/353(M+H$^+$-CO_2- 异丁烯), 395/397(M+H$^+$- 异丁烯),451/453(M+H$^+$)。

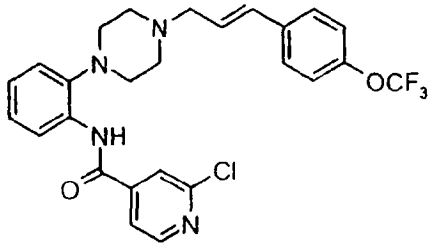
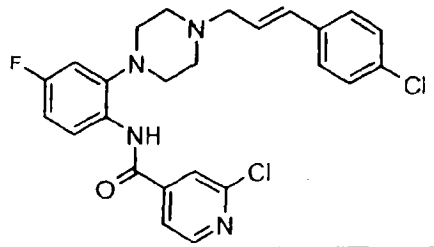
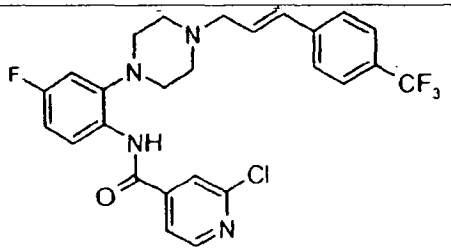
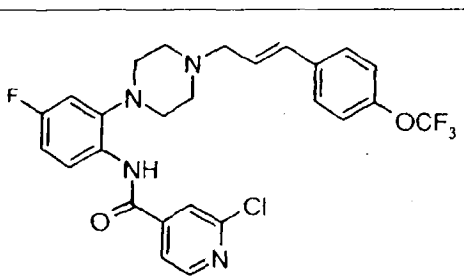
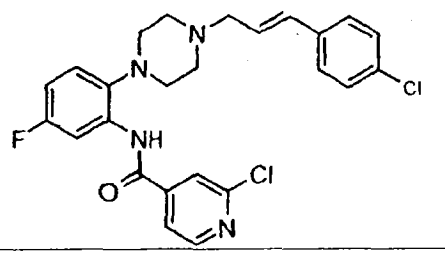
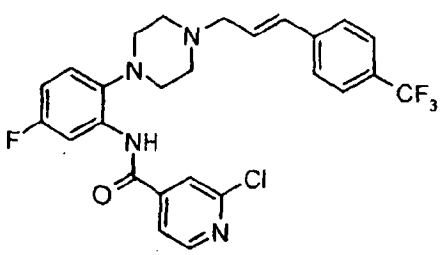
[0261] 步骤 D：在室温下将步骤 C 所获得化合物 (200mg) 的二氯甲烷 (10ml) 溶液用三氟乙酸 (0.3ml) 处理 48 小时。将所得混合物用饱和碳酸氢钠水溶液碱化，然后用二氯甲烷萃取两次，用硫酸钠干燥合并的有机层并真空浓缩。将所得残余物在乙腈 (20ml) 中溶解，然后加入二异丙基乙胺 (0.16ml) 和 4- 氯肉桂酰氯 (96mg)。将溶液在室温下搅拌 50 小时，真空脱去溶剂，残余物用硅胶色谱法处理 (环己烷：乙酸乙酯＝ 7 ： 2) 获得标题产物 (162mg)，为黄色固体。M.p.129-132℃；^{1}H NMR(400MHz, $CDCl_3$) 2.7(m,4H),2.9(m,4H), 3.2(d, J ＝ 9Hz,2H),6.2(dt, J ＝ 18,9Hz,1H),6.5(d, J ＝ 18Hz,1H),7.1-7.3(m,6H), 7.6(d, J ＝ 5.5Hz,1H),7.70(s,1H),8.4(d, J ＝ 10Hz,1H),8.5(d, J ＝ 5.5Hz,1H),9.4(s, 1H,NH)；保留时间 HPLC2.46min；MS(ES+)501/503/505(M+H$^+$)。

[0262] 根据类似于实施例 1 中所描述的方法制备得到下列化合物：

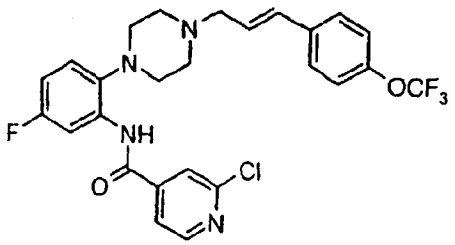
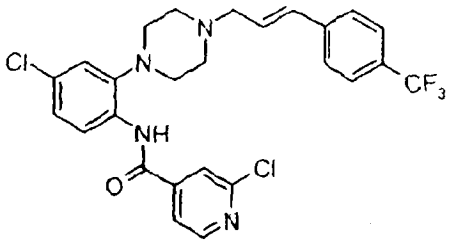
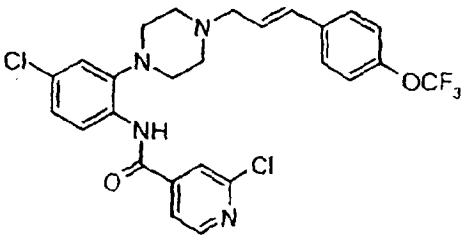
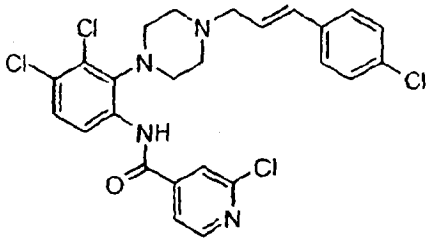
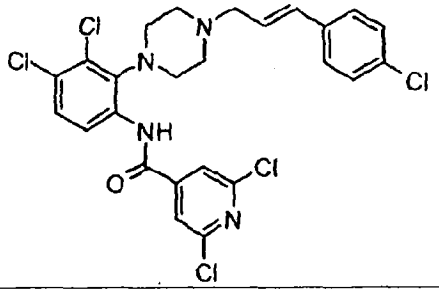
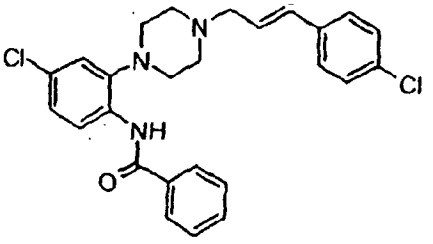
[0263]

化合物	结构	M.p (℃)	MH^+	保留时间(min)
2-氯-N-(2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺			467/469	2.26
2-氯-N-(2-{4-[(E)-3-(4-三氟甲基-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺			501	2.32

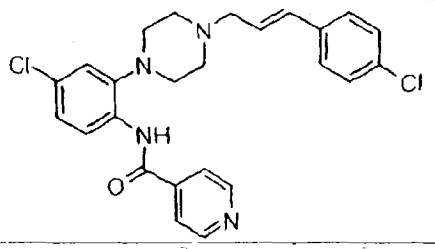
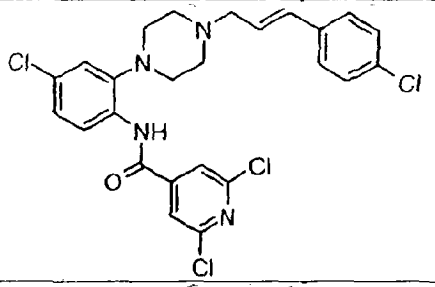
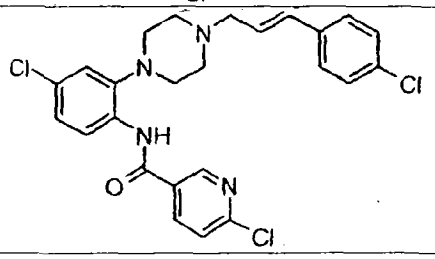
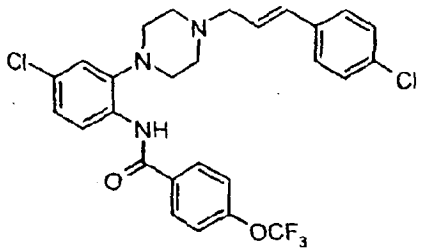
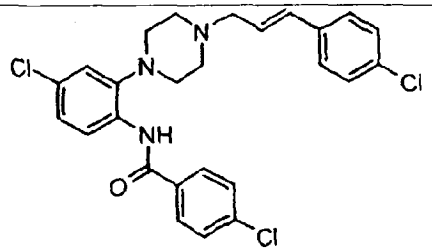
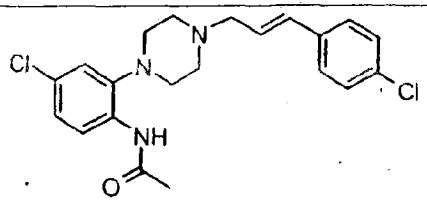
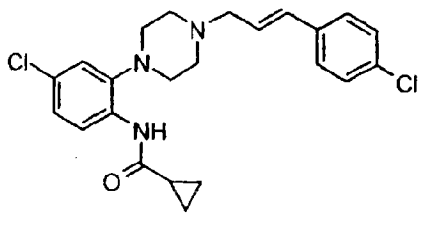
[0264]

2-氯-N-(2-{4-[(E)-3-(4-三氟甲氧基-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺			517	2.46
2-氯-N-(4-氟-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺		145-147	485/487	2.29
2-氯-N-(4-氟-2-{4-[(E)-3-(4-三氟甲基-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺		98-100	519	1.91
2-氯-N-(4-氟-2-{4-[(E)-3-(4-三氟甲氧基-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺		85-89	535/537	2.44
2-氯-N-(5-氟-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺		80-83	485/487	2.28
2-氯-N-(5-氟-2-{4-[(E)-3-(4-三氟甲基-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺		105-109	519	2.51

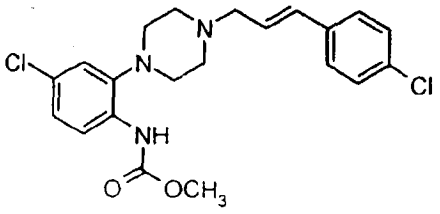
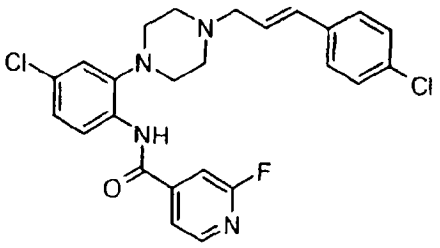
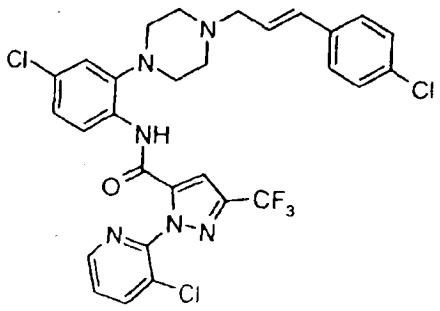
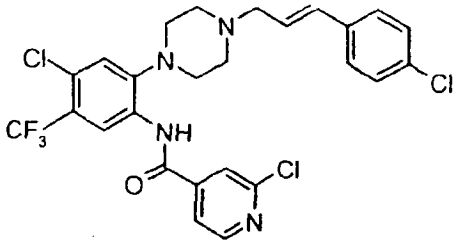
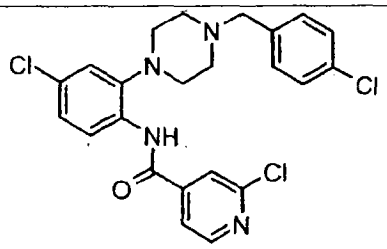
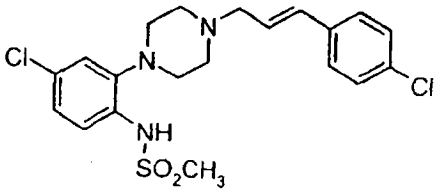
[0265]

2-氯-N-(5-氟-2-{4-[(E)-3-(4-三氟甲氧基-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺		110-114	535	2.48
2-氯-N-(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-三氟甲基-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺		129/131	535/537	2.56
2-氯-N-(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-三氟甲氧基-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺		92-95	551/553	2.63
2-氯-N-(3,4-二氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺		154-156	537/539	2.38
2,6-二氯-N-(3,4-二氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺		178/181	571/573	2.67
N-(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-苯甲酰胺		79-81	466/468	2.49

[0266]

N-(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺		152-154	467-469	2.11
2,6-二氯-N-(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺		121-123	537/539	2.77
6-氯-N-(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺		120-123	467/469	2.10
N-(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-4-三氟甲氧基-苯甲酰胺		104-107	550/552	3.22
N-(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-4-氯-苯甲酰胺		62-64	502/504	2.85
N-(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-乙酰胺		145-148	404/406	1.95
(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-环丙羧酰胺		87-89	430/432	2.17

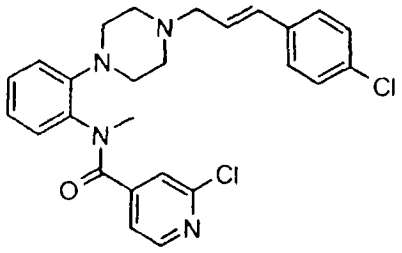
[0267]

(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-氨基甲酸甲酯		73-76	420/422	2.17
2-氟-N-(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺		162-165	485/487	2.31
(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-2-(3-氯-吡啶-2-基)-5-三氟甲基-2H-吡唑-3-羧酰胺		97-100	637/639	2.65
2-氯-N-(4-氯-5-三氟甲基-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-异烟酰胺		135-136	569/571	2.92
2-氯-N-{4-氯-2-[4-(4-氯-苯基)-哌嗪-1-基]-苯基}-异烟酰胺		116-118	475/477	2.50
N-(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-甲磺酰胺		81-83	440-442	2.01

[0268] 实施例 2

[0269] 本实施例说明了 2-氯 -N-(2-{4-[(E)-3-(4-氯苯基)-烯丙基]-哌嗪 -1-基}-苯基)-N- 甲基 - 异烟酰胺的制备。

[0270]

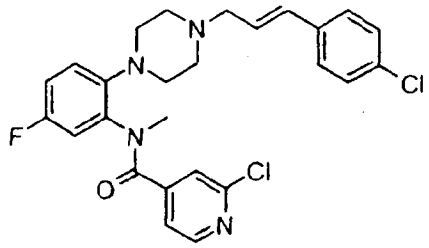
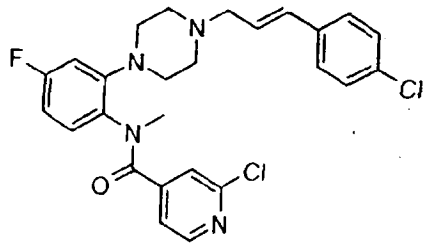
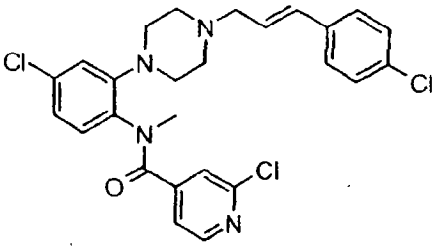
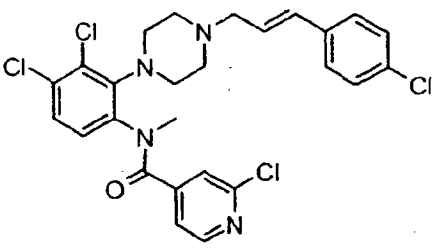


[0271] 在0℃下往氢化钠(50％的油液,24mg)的四氢呋喃悬浮液中加入4-{2-[(2-氯-吡啶-4-羰基)-氨基]-苯基}-哌嗪-1-甲酸特丁基酯(100mg,如实施例1步骤A-C中所述方法制备),并将所得混合物在0℃下搅拌1小时,同时加入碘甲烷(0.03ml)。将反应混合物在室温下搅拌3小时,然后用乙酸乙酯稀释,用水洗涤三次,用硫酸钠干燥并真空浓缩。所得残余物用硅胶色谱法处理(环己烷:乙酸乙酯=7:3)得到4-{2-[(2-氯-吡啶-4-羰基)-甲基-氨基]-苯基}-哌嗪-1-甲酸特丁基酯,为白色晶体。M.p.59-61℃;^{1}H NMR(400MHz, $CDCl_3$)1.5(s,9H),2.2(m,2H),2.8(m,2H),3.4(m,2H),3.4(s,3H),3.5(m,2H),6.7(m,1H),6.9(m,1H),7.0-7.3(m,4H),8.1(m,1H);MS(ES+)331($M+H^+-CO_2$-异丁烯),375($M+H^+$-异丁烯),431($M+H^+$)。

[0272] 将该化合物根据实施例1步骤D的方法处理获得标题产物,为黄色晶体。M.p.117-120℃;^{1}H NMR(400MHz, $CDCl_3$)2.4(m,2H),2.5(m,2H),2.6(m,2H),2.9(m,2H),3.2(m,2H),3.5(s,3H),3.5(m,2H),6.2(dt, J = 18,9Hz,1H),6.5(d, J = 18Hz,1H),6.8(d, J = 9Hz,1H),6.9(d, J = 5Hz,1H),7.0-7.3(m,6H),8.1(d, J = 5Hz,1H);保留时间HPLC2.17min;MS(ES+)481/483($M+H^+$)。

[0273] 根据类似于实施例2中所描述的方法制备得到下列化合物:

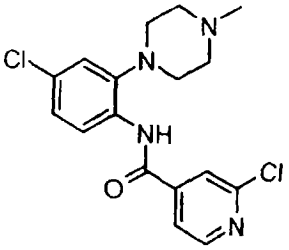
[0274]

化合物	结构	M.p (℃)	MH^+	保留时间(min)
2-氯-N-(5-氟-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-N-甲基-异烟酰胺		60-64	499/501	2.12
2-氯-N-(4-氟-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-N-甲基-异烟酰胺		110-117	499/501	2.09
2-氯-N-(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-N-甲基-异烟酰胺		130-133	517-519	2.28
2-氯-N-(3,4-二氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-N-甲基-异烟酰胺		112-115	551/553	2.42

[0275] 实施例 3

[0276] 本实施例说明了 2- 氯 -N-[4- 氯 -2-(4- 甲基 - 哌嗪 -1- 基)- 苯基]- 异烟酰胺的制备。

[0277]



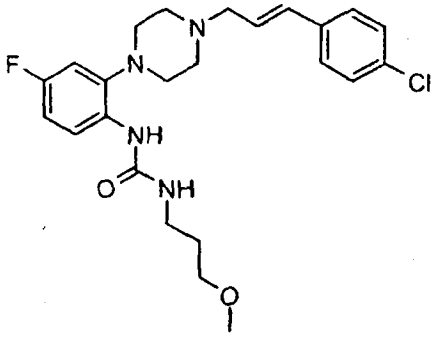
[0278] 步骤 A :将 4-{5- 氯 -2-[(2- 氯吡啶 -4- 羰基)- 氨基]- 苯基 }- 哌嗪 -1- 甲酸特丁基酯 (6.7g,实施例 1,步骤 C) 在二氯甲烷 (20ml) 中的溶液在室温下用三氟乙酸 (10ml) 处理 20 小时。减压浓缩溶剂得到 2- 氯 -N-[4- 氯 -2-(哌嗪 -1- 基)- 苯基]- 异烟酰胺三氟醋酸盐 (6.9g),为棕色固体。MS(ES+)351/353($M+H^+$)。

[0279] 步骤 B：将步骤 A 中所获得的产物 (300mg)、甲酸 (16ml) 和 37％甲醛水溶液 (0.47ml) 回流 2 小时。用水稀释反应混合物，用饱和碳酸氢钠水溶液碱化并用乙酸乙酯萃取。用无水硫酸钠干燥有机层并真空浓缩。残余物用硅胶色谱法处理（乙酸乙酯：甲醇＝8 ： 2) 得到标题产物。M.p.118-120℃ ；^{1}H NMR(400MHz, $CDCl_3$)2.4(s,3H),2.7(m,2H),3.0(m,4H),7.2(m,2H),7.6(d,J ＝ 5.0Hz,1H),7.7(s,1H),8.4(d,J ＝ 9.0Hz,1H),8.5(d,J ＝ 5.0Hz,1H),9.4(brs,1H) ；MS(ES+)365/367($M+H^+$)。

[0280] 实施例 4

[0281] 本实施例说明了 1-(2-{4-[(E)-3-(4- 氯苯基)- 烯丙基]- 哌嗪 -1- 基}-4- 氟苯基)-3-(3- 甲氧基 - 丙基)- 脲的制备。

[0282]



[0283] 步骤 A：将 4-(5- 氟 -2- 硝基苯)- 哌嗪 -1- 甲酸特丁基酯 (10g，如实施例 1 步骤 A 中所述由 2,4- 二氟硝基苯制备）的二氯甲烷 (80ml) 溶液在室温下用三氟乙酸 (23ml) 处理 24 小时。真空浓缩反应混合物。将所得残余物在乙腈 (100ml) 中溶解，然后加入二异丙基乙胺 (27ml) 和 4- 氯肉桂酰氯 (6.8g)。将溶液在室温下搅拌 17 小时，真空脱去溶剂，将所得残余物用硅胶色谱法处理（环己烷：乙酸乙酯＝ 1 ： 1) 获得 1-[(E)-3-(4- 氯 - 苯基)- 烯丙基]-4-(5- 氟 -2- 硝基 - 苯基)- 哌嗪 (10.5g) ；^{1}H NMR(400MHz, $CDCl_3$)2.7(t, J ＝ 8Hz,4H),3.1(t, J ＝ 8Hz,4H),3.2(d,J ＝ 9Hz,2H),6.2(dt,J ＝ 18,9Hz,1H),6.5(d,J ＝ 18Hz,1H),6.6(dt, J ＝ 1.0,7.0Hz,1H),6.7(dd, J ＝ 1.0,10Hz,1H),7.2-7.3(m,4H),7.8(d,J ＝ 7.0,10.0Hz,1H) ；MS(ES+)151/153,376/378($M+H^+$)。

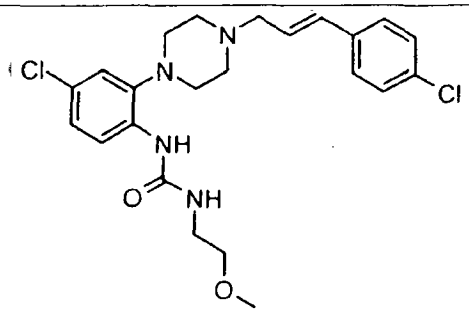
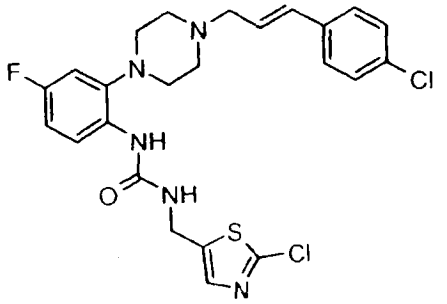
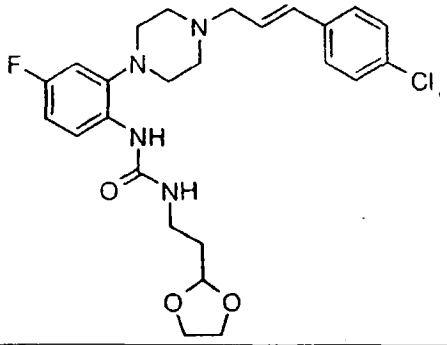
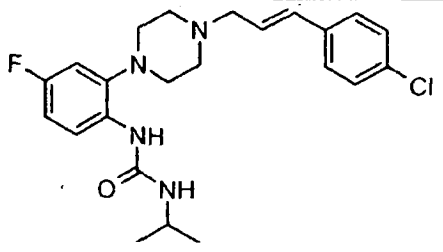
[0284] 步骤 B：在 60℃下往搅拌的步骤 A 所获得化合物 (8.0g) 的乙醇 (66ml) 和水 (80ml) 的悬浮液中加入连二亚硫酸钠 (11g)。将所得混合物在 60℃搅拌 1 小时，然后在真空下脱去乙醇。用乙酸乙酯萃取悬浮液三次，用硫酸钠干燥合并的有机层并真空浓缩。将所得残余物过硅胶柱（洗脱液乙酸乙酯）得到 1-[(E)-3-(4- 氯 - 苯基)- 烯丙基]-4-(5- 氟 -2- 氨基苯基)- 哌嗪 (4.1g)。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)2.6(m,4H),2.9(m,4H),3.2(d, J ＝ 9Hz,2H),3.7(m,2H),6.2(dt, J ＝ 18.9Hz,1H),6.5(d, J ＝ 18Hz,1H),6.6(m,2H),6.7(d, J ＝ 10Hz,1H),7.2-7.3(m,4H) ；MS(ES+)151/153,346/348($M+H^+$)。

[0285] 步骤 C：在氮气下往搅拌的碳酸二特丁基酯 (266mg) 的二氯甲烷 (4ml) 溶液中加入 4- 二甲氨基吡啶 (106mg) 的二氯甲烷 (4ml) 溶液，随后加入步骤 B 中所获得的产物 (300mg)。在室温下搅拌溶液直至脱气终止。然后滴加入溶于二氯甲烷 (4ml) 的 3- 甲氧丙氨基 (155mg) 溶液，并将所得溶液在室温下搅拌 1 小时。减压脱去溶剂，将所得残余物用硅胶色谱法（环己烷：乙酸乙酯＝ 1 ： 9) 纯化获得标题化合物 (210mg)。M.p.86-90℃ ；^{1}H NMR(400MHz, $CDCl_3$)1.8(quint, J ＝ 7Hz,2H),2.6(m,4H),2.9(m,4H),3.2(d, J ＝ 9Hz,

2H),3.2(s,3H),3.3(q,J = 7Hz,2H),3.4(t,J = 7Hz,2H),5.3(m,1H),6.2(dt,J = 18,9Hz,1H),6.5(d,J = 18Hz,1H),6.8(m,2H),6.9(s,1H),7.2-7.3(m,6H),7.7(m,1H);保留时间HPLC1.93;MS(ES+)372/374,461/463($M+H^+$)。

[0286] 根据类似于实施例4中所描述的方法制备得到下列化合物:

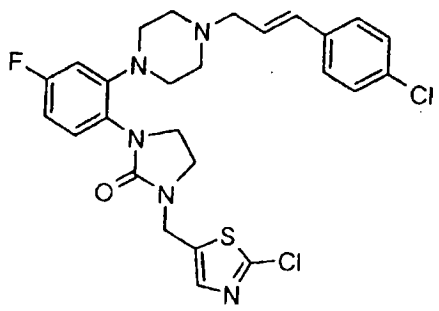
[0287]

化合物	结构	M.p (℃)	MH^+	保留时间(min)
1-(4-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-苯基)-3-(2-甲氧基-乙基)-脲		178	463/465	1.97
1-(2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-4-氟-苯基)-3-(2-氯-噻唑-5-基甲基)-脲		94-98	520/522	2.12
1-(2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-4-氟-苯基)-3-(2-[1,3]二氧唑烷-2-基-乙基)-脲		76-80	489	2.02
1-(2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-4-氟-苯基)-3-异丙基-脲		162-166	431	2.08

[0288] 实施例5

[0289] 本实施例说明了1-(2-{4-[(E)-3-(4-氯苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-4-氟苯基)-3-(2-氯噻唑-5-基甲基)-咪唑烷-2-酮的制备。

[0290]



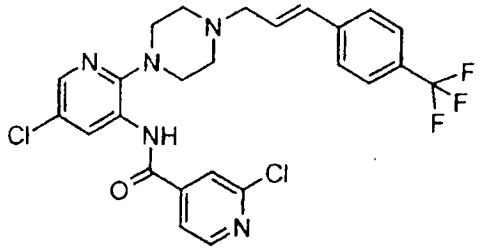
[0291] 步骤 A：在 0℃下往 1-[(E)-3-(4- 氯苯基)- 烯丙基]-4-(5- 氟 -2- 氨基 - 苯基)- 哌嗪 (1.0g，实施例 3，步骤 B) 的四氢呋喃 (10ml) 溶液中加入 2- 氯乙基异氰酸酯 (327mg) 并在氮气下于室温搅拌所得溶液 18 小时。将残余物溶解于最少量的四氢呋喃中，然后将其加入到氢化钠 (146mg，50％的油溶液) 的四氢呋喃 (10ml) 悬浮液中。在室温下搅拌反应混合物 3 小时，减压浓缩，然后用二乙醚粉化获得 1-(2-{4-[(E)-3-(4- 氯苯基)- 烯丙基]- 哌嗪 -1- 基}-4- 氟 - 苯基)- 咪唑烷 -2- 酮 (677mg) 白色晶体。M.p. 170-172℃；^{1}H NMR(400MHz，$CDCl_3$) 2.7(m，4H)，3.11(m，4H)，3.26(d，J ＝ 6.8Hz，2H)，3.63(t，J ＝ 5.7Hz，2H)，3.99(t，J ＝ 5.7Hz，2H)，5.12(brs，1H)，6.32(dt，J ＝ 15.6，6.8Hz，1H)，6.57(d，J ＝ 15.6Hz，1H)，6.82(m，2H)，7.3-7.4(m，4H)；MS(ES+) 415/417($M+H^+$)。

[0292] 步骤 B：在 0℃将溶于二甲基乙酰胺 (4ml) 的步骤 A 所获产物 (250mg) 加入到氢化钠 (50％的油溶液，29mg) 在二甲基乙酰胺 (4ml) 的悬浮液中，并将所得混合物在 0℃搅拌 30min，同时加入溶于二甲基乙酰胺 (4ml) 的 C-(2- 氯 - 噻唑 -5- 基)- 甲胺 (102mg)。将反应混合物在室温下搅拌 2 小时，然后加水猝灭反应，用乙酸乙酯萃取 (三次)，用硫酸钠干燥并真空浓缩。残余物用硅胶色谱法处理 (环己烷：乙酸乙酯＝ 1 ： 9) 得到标题产物，为黄色固体。M.p. 72-77℃；^{1}H NMR(400MHz，$CDCl_3$) 2.7(m，4H)，3.0(m，4H)，3.2(d，J ＝ 7Hz，2H)，3.35(t，J ＝ 6Hz，2H)，3.8(t，J ＝ 6Hz，2H)，4.5(s，2H)，6.3(dt，J ＝ 16.7Hz，1H)，6.5(d，J ＝ 16Hz，1H)，6.8(m，2H)，7.2-7.3(m，4H)，7.4(s，1H)；MS(ES+) 546/548($M+H^+$)。

[0293] 实施例 6

[0294] 本实施例说明了 2- 氯 -N-(5- 氯 -2-{4-[(E)-3-(4- 三氟甲基 - 苯基)- 烯丙基]- 哌嗪 -1- 基}- 吡啶 -3- 基)- 异烟酰胺的制备。

[0295]



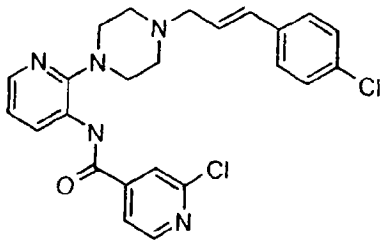
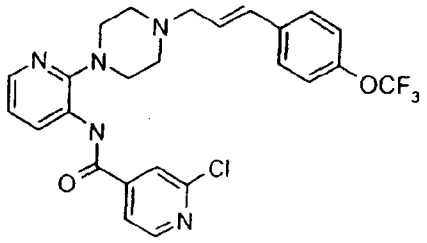
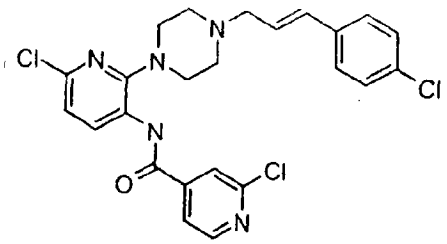
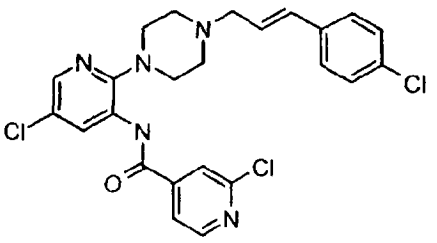
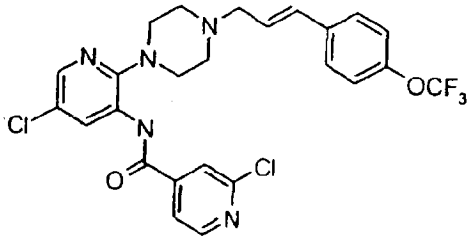
[0296] 步骤 A：在 0℃和 N_2 下，将哌嗪 (1.38g) 加入到搅拌的 2,6- 二氯 -3- 硝基吡啶 (3.0g，根据 J.Heterocyclic Chem.1994，31，73 制备) 和二异丙基乙胺 (3.0ml) 在二氯甲烷 (100ml) 中的溶液中。将所得混合物在室温下搅拌 2 小时然后倒入饱和的碳酸氢钠水溶液中，用二氯甲烷萃取，然后用硫酸钠干燥并真空浓缩。硅胶色谱法处理所得残余物 (乙酸乙酯：甲醇＝ 8 ： 2) 得到 1-(6- 氯 -3- 硝基吡啶 -2- 基)- 哌嗪 (2.99g)，为红色固体。M.p. 50-53℃；MS(ES+) 243/245($M+H^+$)。

[0297] 步骤 B：将在步骤 A 中获得的产物 (800mg) 溶于乙腈 (320ml)，然后加入二异丙基乙胺 (1.2ml) 和 4- 三氟甲基肉桂酰氯 (728mg)。将溶液在室温下搅拌 24 小时，真空脱去溶剂，将所得残余物用硅胶色谱法处理 (环己烷：乙酸乙酯＝ 7 ： 3) 获得 1-(5- 氯 -3- 硝基 - 吡啶 -2- 基)-4-[(E)-3-(4- 三氟甲基 - 苯基)- 烯丙基]- 哌嗪 (0.79g)，为黄色泡沫状物。M.p.129-132℃；^{1}H NMR(400MHz，$CDCl_3$)2.7(m,4H)，3.3(d，J ＝ 9Hz，1H)，3.5(m,4H)，6.3(dt，J ＝ 18,9Hz,1H)，6.5(d，J ＝ 18Hz,1H)，7.4(m,4H)，8.2(d，J ＝ 2Hz,1H)，8.3(d，J ＝ 2Hz,1H) ；MS(ES+)427/429($M+H^+$)。

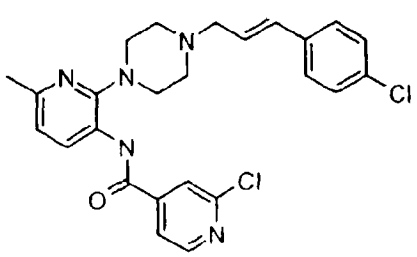
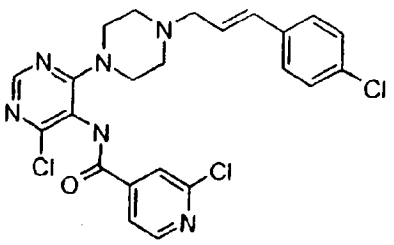
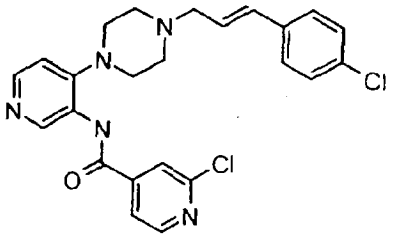
[0298] 步骤 C：根据实施例 1 步骤 B 和 C 中所描述的方法对步骤 B 中所获得的产物 (435mg) 进行还原和酰化，经过硅胶色谱法 (环己烷：乙酸乙酯＝ 7 ： 3) 后获得标题产物 (185mg)。M.p.156-159℃；^{1}H NMR(400MHz，$CDCl_3$)2.7(m,4H)，3.1(m,4H)，3.2(d，J ＝ 9Hz，2H)，6.3(dt，J ＝ 18,9Hz,1H)，6.5(d，J ＝ 18Hz,1H)，7.4(d，J ＝ 9Hz,2H)，7.45(d，J ＝ 9Hz，2H)，7.5(d，J ＝ 5Hz,1H)，7.6 (s,1H)，8.0(d，J ＝ 1.5Hz,1H)，8.55(d，J ＝ 5Hz,1H)，8.65(d，J ＝ 1.5Hz,1H)，8.8(s,1H,NH) ；HPLC 保留时间 2.12min ；MS(ES+)536/538($M+H^+$)。

[0299] 根据类似于实施例 6 中所描述的方法制备得到下列化合物：

[0300]

化合物	结构	M.p (℃)	MH^+	保留时间(min)
2-氯-N-(2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-吡啶-3-基)-异烟酰胺		106-109	468/470	2.05
2-氯-N-(2-{4-[(E)-3-(4-三氟甲氧基-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-吡啶-3-基)-异烟酰胺			518/520	2.19
2-氯-N-(6-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-吡啶-3-基)-异烟酰胺		70-73	502/504	2.16
2-氯-N-(5-氯-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-吡啶-3-基)-异烟酰胺		127-129	502/504	2.29
2-氯-N-(5-氯-2-{4-[(E)-3-(4-三氟甲氧基-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-吡啶-3-基)-异烟酰胺		115-117	552/554	2.40

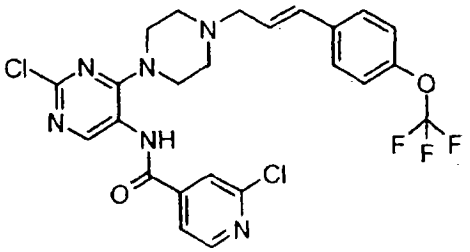
[0301]

2-氯-N-(6-甲基-2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-吡啶-3-基)-异烟酰胺		67-70	482/484	2.44
2-氯-N-(4-氯-6-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-嘧啶-5-基)-异烟酰胺		84-87	503/505	2.48
2-氯-N-(4-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-嘧啶-3-基)-异烟酰胺		77-79	468/470	1.99

[0302] 实施例 7

[0303] 本实施例说明了 2- 氯 -N-(2- 氯 -4-{4-[(E)-3-(4- 三氟甲氧基 - 苯基)- 烯丙基]- 哌嗪 -1- 基 }- 吡啶 -5- 基)- 异烟酰胺的制备。

[0304]

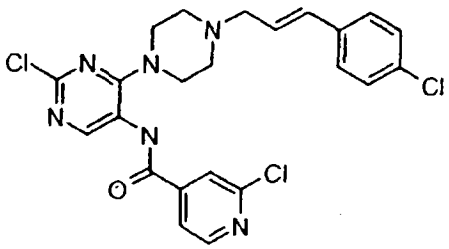
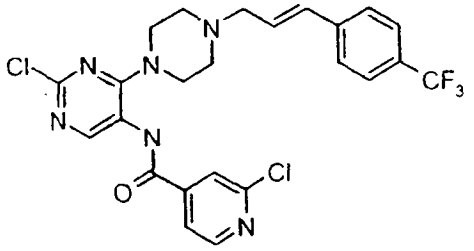


[0305] 根据在实施例 1 步骤 A 中所描述的方法在三乙胺 (5.3ml) 存在下在二甲亚砜中 (20ml) 使 1-t- 丁氧羰基 - 哌嗪 (2.36g) 与 2,4- 二氯 - 嘧啶 -5- 基胺 (2.0g) 缩合，获得 4-(5- 氨基 -2- 氯 - 嘧啶 -4- 基)- 哌嗪 -1- 甲酸特丁基酯 (3.4g)，为紫色晶体。MS(ES+)314/316(M+H$^+$)。可根据实施例 1 步骤 C 和 D 中所描述的中间体制备得到标题产物 2- 氯 -N-(2- 氯 -4-{4-[(E)-3-(4- 三氟甲氧基 - 苯基)- 烯丙基]- 哌嗪 -1- 基 }- 吡啶 -5- 基)- 异烟酰胺 (120mg)。

[0306] M.p.210-211 ℃ ;^{1}H NMR(400MHz, $CDCl_3$)2.5(m,4H),3.1(d, J = 9Hz,1H),3.6(m,4H),6.1(dt, J = 18,9Hz,1H),6.4(d, J = 18Hz,1H),7.1(d, J = 11Hz,2H),7.3(d, J = 11Hz,2H),7.6(d,J = 5Hz,1H),7.7(s,1H),7.8(s,1H,NH),8.4(s,1H),8.5(d,J = 5Hz,1H) ; MS(ES+)553/555(M+H$^+$)。

[0307] 根据类似于实施例 7 中所描述的方法制备得到下列化合物：

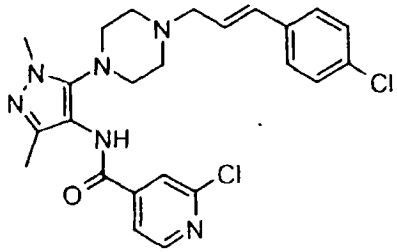
[0308]

化合物	结构	M.p (℃)	MH^+	保留时间 (min)
2-氯-N-(2-氯-4-{4-(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-嘧啶-5-基)-异烟酰胺		187-189	503/505	2.09
2-氯-N-(2-氯-4-{4-[(E)-3-(4-三氟甲基-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-嘧啶-5-基)-异烟酰胺		169-173	537/539	2.21

[0309] 实施例 8

[0310] 本实施例说明了 2-氯-N-(5-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-基)-异烟酰胺的制备。

[0311]



[0312] 步骤 A：在 0℃ 和 N_2 下，用 4-氯肉桂酰氯 (5g) 处理 N-BOC-哌嗪 (4.3g) 和三乙胺 (9ml) 在二甲亚砜 (40ml) 中的溶液，并将所得溶液在室温下搅拌 18 小时，倒入水中，用乙酸乙酯萃取（三次），用 硫酸钠干燥并真空浓缩。将残余物过硅胶柱得到粗 4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-甲酸特丁基酯。将该化合物溶于二氯甲烷 (30ml) 并在室温下用三氟乙酸 (10ml) 处理 18 小时。浓缩得到 1-[(E)-3-(4-氯苯基)-烯丙基]-哌嗪 (5.8g)，其通过质谱和 NMR 谱来表征。MS(ES+) 151/153(M-哌嗪)，237/239($M+H^+$)。

[0313] 步骤 B：根据实施例 1 步骤 A 中所描述的方法在三乙胺 (3.4ml) 存在下在二甲亚砜 (20ml) 中使步骤 A 中所获得的产物 (3.1g) 与 5-氯-1,3-二甲基-4-硝基-1H-吡唑 (1.5g) 缩合获得 1-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-4-(2,5-二甲基-4-硝基-2H-吡唑-3-基)-哌嗪 (1.82g)，为棕色固体。^1H NMR(400MHz, $CDCl_3$) 2.4(s,3H), 2.6(m,4H), 3.2(m,6H), 3.7(s,3H), 6.3(dt, J = 18,9Hz,1H), 6.5(d, J = 18Hz,1H), 7.2-7.3(m,4H)；MS(ES+) 151/153,376/378($M+H^+$)。

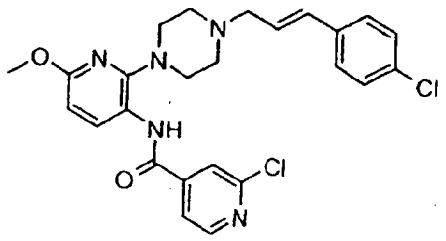
[0314] 步骤 C：在室温和氮气下往步骤 B 中所获得产物 (800mg) 在四氢呋喃 (8ml) 和甲醇

(8ml) 中的溶液中加入一水氯化锡 (II) (2.9g) 和三水乙酸钠 (3.5g)。将所得的混合物在室温下搅拌 34 小时。将反应混合物在 1M 氢氧化钠和乙酸乙酯中分离，搅拌 10min，分离有机层，用硫酸钠干燥并浓缩，获得 1-[(E)-3-(4- 氯苯基)- 烯丙基]-4-(2,5- 二甲基 -4- 氨基 -2H- 吡唑 -3- 基)- 哌嗪 (510mg)，为红色固体。^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)2.3(s,3H),2.8(m,4H),3.3(m,4H),3.4(d, J = 9Hz,2H),3.8(s,3H),6.4(dt, J = 18,9Hz,1H),6.7(d, J = 18Hz,1H),7.3-7.4(m,4H) ;MS(ES+)151/153(肉桂基),196(M- 肉桂基),346/348($M+H^+$)。

[0315] 步骤 D :往搅拌的步骤 C 所获得化合物 (250mg) 的二氯甲烷 (10ml) 溶液中加入三乙胺 (0.46ml) ;将溶液冷却到 0℃并加入 2- 氯异烟酰氯 (250mg)。将所得混合物在室温下搅拌 12 小时，然后倒入水中，用二氯甲烷萃取两次，用硫酸钠干燥合并的有机层并真空浓缩。所得残余物用硅胶色谱法 (乙酸乙酯 : 乙醇 = 9 : 5) 处理得到标题化合物 (158mg)。M.p.85-88℃ ;^{1}H NMR(400MHz, $CDCl_3$)2.0(s,3H), 2.52(brs,4H),3.05(t, J = 4.8Hz,4H), 3.1(d, J = 6.8Hz,2H),3.58(s,3H),6.13(dt, J = 15.6,6.8Hz,1H),6.40(d, J = 15.6Hz, 1H),7.20(s,4H),7.55(d, J = 5.2Hz,1H),7.69(s,1H),8.49(d, J = 5.2Hz,1H) ;保留时间 LCMS2.26min ;MS(ES+)485/487($M+H^+$)。

[0316] 根据类似于实施例 8 中所描述的方法制备得到下列化合物 :

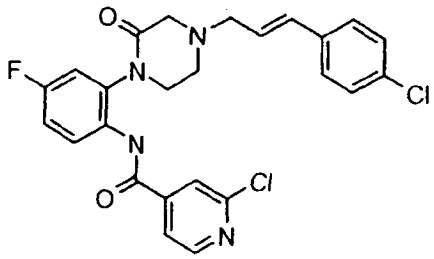
[0317]

化合物	结构	M.p (℃)	MH^+	保留时间 (min)
2- 氯 -N-(2-{4-[(E)-3-(4- 氯 - 苯基)- 烯丙基]- 哌嗪 -1- 基}-6- 甲氧基 - 吡啶 -3- 基)- 异烟酰胺		65-69	498/500	2.39

[0318] 实施例 9

[0319] 本实施例说明了 2- 氯 -N-(2-{4-[(E)-3-(4- 氯 - 苯基)- 烯丙基]-2- 氧 - 哌嗪 -1- 基 -4- 氟 - 苯基 }- 异烟酰胺的制备。

[0320]



[0321] 步骤 A :根据 US6433134 中描述的方法制备哌嗪酮 :在室温下和氮气下往乙二胺 (32.85ml) 的乙醇 (150ml) 溶液中滴加在乙醇 (50ml) 中的氯甲酸乙酯 (10g)。将所得溶液在室温下搅拌 48 小时，然后在 30min 内滴加入新制的乙酸钠的乙醇溶液 (用 1.9g 钠和 90ml 乙醇制备)。将溶液在室温下搅拌 2 小时，Hyflo 过滤 (用乙醇冲洗)，然后在真空中脱去

溶剂和过量的二胺。将油状残余物在甲苯 (400ml) 中回流 3 小时，轻轻倒出甲苯层并使其与剩下的油分离；将甲苯层在 0℃下过夜，过滤固体得到哌嗪酮 (3.6g)。M.p.108-109℃。

[0322] 步骤 B：将哌嗪酮 (3.6g) 溶于乙腈 (100ml) 然后用二异丙基乙胺 (9ml) 和 4- 氯肉桂酰氯 (6.7g) 处理。在室温和氮气下搅拌所得反应混合物 48 小时。过滤收集白色沉淀，用冰乙腈洗涤并在真空下干燥（白色固体，4.35g）。在真空下浓缩滤液，用乙腈结晶所得残余物（白色晶体，1.4g）。M.p.129-130℃。两个部分获得的 N-4-[(E)-3-(4- 氯苯基)- 烯丙基]- 哌嗪 -2- 酮都展现出令人满意的分析数据：^{1}H NMR(400MHz,$CDCl_3$)2.63(t,J = 5Hz,2H),3.12(s,2H),3.15(d,J = 7Hz,2H),3.32(m,2H),6.1(dt,J = 18,9Hz,1H),6.5(d,J = 18Hz,1H),7.2-7.3(m,4H)。

[0323] 步骤 C：在室温和氮气下往步骤 B 所获得产物 (2.51g) 的二甲基甲酰胺 (50ml) 溶液中加入碳酸钾 (3.45g) 和 2,4- 二氟硝基苯 (1.59g)。将所得的混合物在 100℃下搅拌 24 小时。再次加入碳酸钾 (1.4g) 和 2,4- 二氟硝基苯 (1.4g)，并将所得混合物在 110℃下搅拌 48 小时。将反应混合物冷却至室温，倒入水中，用乙酸乙酯萃取三次；用盐水洗涤合并的有机层，干燥 (Na_2SO_4) 并真空浓缩。柱色谱法（环己烷 / 乙酸乙酯 = 6 ： 4) 得到 4-[(E)-3-(4- 氯 - 苯基)- 烯丙基]-1-(5- 氟 -2- 硝基苯基)- 哌嗪 -2- 酮 (1.9g)，为棕色固体。M.p.57℃；MS(ES+)151/153（肉桂基），390/392($M+H^+$)。

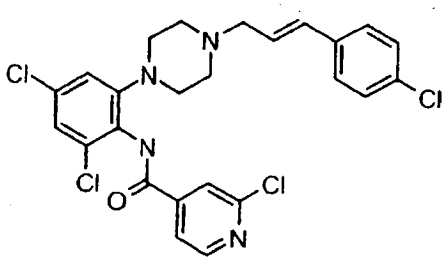
[0324] 步骤 D：往步骤 C 所获得化合物 (389mg) 的乙醇 (10ml) 溶液中加入兰尼镍 (50％水悬浮液，200mg)；再加入水合肼 (0.5ml)，并在室温下搅拌所得反应混合物直至脱气中止 (1 小时)。Hyflo 过滤反应混合物，真空脱去溶剂，所得残余物用柱色谱法 (2.5％的甲醇在乙酸乙酯中的溶液) 纯化得到 1-(2- 氨基 -5- 氟苯基)-4-[(E)-3-(4- 氯苯基)- 烯丙基]- 哌嗪 -2- 酮 (162mg)。保留时间 LCMS2.81min；MS(ES+)360/362($M+H^+$)。

[0325] 步骤 E：往搅拌的步骤 D 所获得化合物 (140mg) 的二氯甲烷 (10ml) 溶液中加入三乙胺 (0.14ml)；将溶液冷却到 0℃并加入 2- 氯异烟酰氯 (200mg)。将所得混合物在室温下搅拌 3 小时，然后倒入水中， 用二氯甲烷萃取两次，用硫酸钠干燥合并的有机层并真空浓缩。所得残余物用硅胶色谱法（乙酸乙酯：环己烷 = 1 ： 1) 处理得到标题化合物 (130mg)，为白色粉末。M.p.75-77℃；保留时间 LCMS3.46min；MS(ES+)150/152,499/501($M+H^+$)。

[0326] 实施例 10

[0327] 本实施例说明了 2- 氯 -N-(2-{4-[(E)-3-(4- 氯 - 苯基)- 烯丙基]- 哌嗪 -1- 基 }-4,6- 二氯 - 苯基)- 异烟酰胺的制备。

[0328]



[0329] 步骤 A：在 80℃和 N_2 下将 1,3,5- 三氯硝基苯 (800mg) 和 1-t- 丁氧羰基 - 哌嗪 (790mg) 的甲苯 (20ml) 溶液搅拌 15 小时。将反应混合物冷却至室温，使其在水和乙酸乙酯中分离，干燥 (Na_2SO_4) 有机层并真空浓缩。硅胶色谱法处理所得残余物（环己烷：乙酸乙酯 = 8 ： 2) 得到 4-(3,5- 二氯 -2- 硝基苯基)- 哌嗪 -1- 甲酸特丁基酯 (0.37g)。^{1}H

NMR(400MHz, $CDCl_3$)1.5(s,9H),2.9(m,4H),3.5(m,4H),7.0(d, J = 2Hz,1H),7.16(d, J = 2Hz,1H) ;保留时间 HPLC2.33min ;MS(ES+)276/278(M-BOC),317/319(M- 异丙烯)。

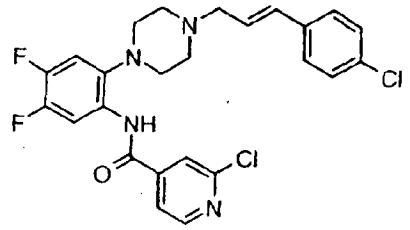
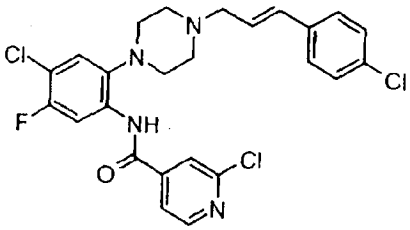
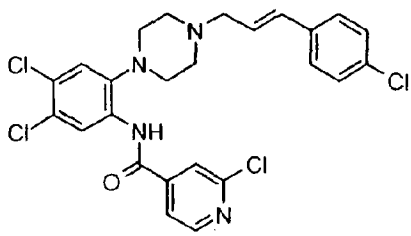
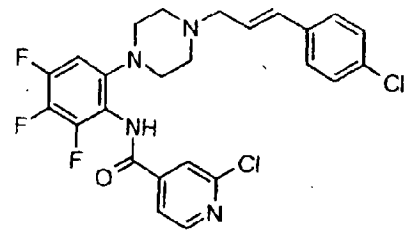
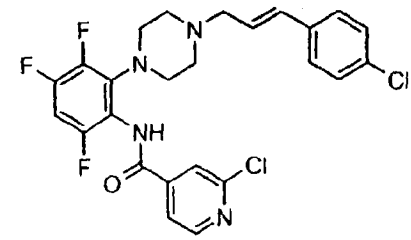
[0330] 步骤 B :如实施例 8 步骤 C 和 D 中所描述的方法用氯化亚锡还原步骤 A 所获得的产物 (200mg) 然后用 2- 氯异烟酰氯酰化,得到 4-{2-[(2- 氯 - 吡啶 -4- 羰基)- 氨基]-3,5- 二氯 - 苯基)- 哌嗪 -1- 甲酸特丁基酯 (1.04g)。保留时间 HPLC2.05min ;MS(ES+)431/433, 485/487/489(MH^+)。

[0331] 步骤 C :在室温下将步骤 C 所获得化合物 (0.08g) 的二氯甲烷 (1ml) 溶液用三氟乙酸 (0.1ml) 处理 24 小时。真空浓缩反应混合物。将所得残余物在乙腈 (1ml) 中溶解,然后加入二异丙基乙胺 (0.15ml) 和 4- 氯肉桂酰氯 (0.05g)。将溶液在室温下搅拌 24 小时,真空脱去溶剂,残余物用硅胶色谱法处理获得标题产物 (66mg),为黄色固体。

[0332] M.p.79-80 ℃ ;^1H NMR(400MHz, $CDCl_3$)2.37(m,4H),2.6(m,4H),3.1(d, J = 9Hz, 2H),6.2(dt, J = 18,9Hz,1H),6.5(d, J = 18Hz,1H),6.9(d, J = 2Hz,1H),7.2-7.3(m, 5H),7.5(s,1H, NH),7.6(d, J = 4.5Hz,1H),7.7(s,1H),8.5(d, J = 5.5Hz,1H) ;保留时间 HPLC1.44min ;MS(ES+)535/537/539($M+H^+$)。

[0333] 根据类似于实施例 10 中所描述的方法制备得到下列化合物 :

[0334]

化合物	结构	M.p (℃)	MH^+	保留时间 (min)
2-氯-N-(2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-4,5-二氟-苯基)-异烟酰胺		55-58	503/505	1.62
2-氯-N-(2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-4-氯-5-氟-苯基)-异烟酰胺		122-123	519	1.52
2-氯-N-(2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-4,5-二氯-苯基)-异烟酰胺		154-155	535/537/539	1.57
2-氯-N-(2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-4,5,6-三氟-苯基)-异烟酰胺		94-96	512/523	1.39
2-氯-N-(2-{4-[(E)-3-(4-氯-苯基)-烯丙基]-哌嗪-1-基}-3,4,6-三氟-苯基)-异烟酰胺		80-82	521/523	1.36

[0335] 实施例 11

[0336] 本实施例说明了式 (I) 化合物的杀虫 / 杀昆虫特性。

[0337] 测试试验如下进行 :

[0338] 棉贪夜蛾 (Spodoptera littoralis)

[0339] 将棉花叶片放置于位于 24 孔微孔板内的琼脂上并以 200ppm 的施用量喷洒试验

液。干燥后，用 $5L_1$ 幼虫侵害叶片。处理 3 天后 (DAT) 检测试样的死亡率、驱虫效果、摄食行为和生长调节率。下列化合物对棉贪夜蛾产生了至少 80％的防治率：

[0340] I-3，I-26，I-29，I-30，I-49，I-52，I-53，I-75，I-417，I-532，I-578，I-785，I-854，I-877，II-49，III-49，V-49，XII-49，XIV-26，XV-26，XXIV-2，XXIV-46，XXIV-90，XXIV-93，XXIV-94，XXV-26 和 XXV-49。

[0341] 烟芽夜蛾 (Heliothis virescens)：

[0342] 将卵 (0-24 小时龄) 放置于位于 24 孔微孔板内的人工饵料上并用移液管施加 200ppm 的试验液。培育 4 天后，检测试样的卵死亡率、幼虫死亡率和生长调节率。下列化合物对烟芽夜蛾产生了至少 80％的防治率：

[0343] I-3，I-6，I-7，I-26，I-29，I-30，I-47，I-49，I-52，I-53，I-72，I-75，I-417，I-532，I-578，I-785，I-854，I-877，III-49，V-49，XII-49，XIV-26，XIV-49，XV-26，XVI-26，XVII-26，XXIV-2，XXIV-46，XXIV-90，XXIV-93，XXIV-94，XXV-2，XXV-26，XXV-49 和 XXV-68。

[0344] 小菜蛾 (Plutella xylostella)：

[0345] 将人工饵料放置在 24 孔微孔板 (MTP) 内并用移液管施加 18.2ppm 的试验液。干燥后，用幼虫 (L2) 侵害 MTP(每孔 10-15 只)。培育 5 天后，检测试样的幼虫死亡率、拒食率和生长调节率。下列化合物对小菜蛾产生了至少 80％的防治率：

[0346] I-26，I-29，I-30，I-49，I-417，I-532，I-578，I-785，I-854，I-877，V-49，IX-49，XII-49，XIV-26，XV-26，XXIV-46，XXIV-90 和 XXV-26。

[0347] 埃及伊蚊 (Aedes aegypti)：

[0348] 将 10-15 只埃及伊蚊 (L2) 与养料混合物一起放置于 96 孔微孔板内。将试验液以 2ppm 的施用量移至孔内。2 天后，检测昆虫的死亡率和生长抑制率。下列化合物对埃及伊蚊产生了至少 80％的防治率：

[0349] I-3，I-26，I-29，I-30，I-49，I-52，I-53，I-72，I-75，I-76，III-49，III-118，XIV-26，XV-26，XXIV-2，XXIV-46，XXIV-90，XXIV-93，XXIV-94 和 XXV-68。

[0350] 桃蚜 (Myzus persicae)：

[0351] 将向日葵叶片放置于位于 24 孔微孔板内的琼脂上并以 200ppm 的施用量喷洒试验液。干燥后，用混合年龄的蚜虫群侵害叶片。经过 6DAT 培育期后，检测试样的死亡率。下列化合物对烟蚜产生了至少 80％的防治率：

[0352] I-3，I-26，I-29，I-26，I-29，I-30，I-49，I-52，I-53，I-72，I-75，III-49，V-49，XXIV-46，XXIV-90 和 XXIV-94。