

發明專利說明書

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號： 97114579

※ 申請日期： 97.4.22

※IPC 分類：

A01N 43/36 (2006.01,

A01N 43/40 (2006.01,

C07D 401/02 (2006.01,

C07D 207/04 (2006.01,

A01P 7/02 (2006.01,

A01P 7/04 (2006.01,

一、發明名稱：(中文/英文)

殺昆蟲性芳基吡咯烷

INSECTICIDAL ARYL PYRROLIDINES

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

拜耳作物科學股份有限公司

BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT

代表人：(中文/英文)

1.包亞歷/BADER, AXEL

2.傑羅夫/JESSE, RALF-RUEDIGER

住居所或營業所地址：(中文/英文)

德國莫罕城艾諾貝耳街 50 號

Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Germany

國 籍：(中文/英文)

德國/GERMANY

三、發明人：(共 7 人)

姓 名：(中文/英文)

1.三原純/MIHARA, JUN

2.村田哲也/MURATA, TETSUYA

3.山崎大銳/YAMAZAKI, DAIEI

4.米田靖/YONETA, YASUSHI

5.涉谷克彥/SHIBUYA, KATSUHIKO

6.下城英一/SHIMOJO, EIICHI

7.巫李奇/GOERGENS, ULRICH

國 籍：(中文/英文)

1.-6.為日本/JAPAN

7.為德國/GERMANY

四、聲明事項：

☐ 主張專利法第二十二條第二項 ☐ 第一款或 ☐ 第二款規定之事實，其事
實發生日期為： 年 月 日。

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

日本；西元 2007 年 04 月 23 日；2007-112855

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

國 籍：(中文/英文)

1.-6.為日本/JAPAN

7.為德國/GERMANY

四、聲明事項：

☐ 主張專利法第二十二條第二項☐第一款或☐第二款規定之事實，其事
實發生日期為： 年 月 日。

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

日本；西元 2007 年 04 月 23 日；2007-112855

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

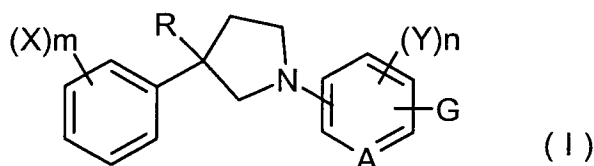
九、發明說明：

本發明係有關新穎之芳基吡咯烷及其作為殺昆蟲劑之用途。

WO2005/085216敘述異噁唑啉經取代之苯甲醯胺化合物可作為害物防治劑用。

本發明人等經精心研究以開發對動物害物(例如昆蟲及蟬蟎)展現較高效力及廣譜之新穎化合物。結果，本發明人等發現顯示極佳(亦即高)活性、具有廣譜且對益蟲(例如蜜蜂)無害，以及對昆蟲害物(特別是對殺昆蟲劑，例如有機磷或胺基甲酸酯製劑具抗性之該等昆蟲)具效力之新穎之芳基吡咯烷。

根據本發明之化合物係以式(I)表示



式中

15 X 可相同或不同，代表鹵素、鹵烷基、硝基、烷基、烷氧基、氰基、鹵烷氧基、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、鹵烷硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、羥基、巰基、胺基、烷基羰胺基、鹵烷基羰胺基、
20 苯甲醯基胺基、烷氧基-羰胺基、鹵烷氧羰胺基、烷基磺醯基胺基或鹵烷基磺醯基胺基；

Y 可相同或不同，代表鹵素、鹵烷基、硝基、烷基、烷氧基、氰基、鹵烷氧基、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷

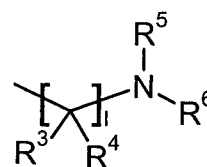
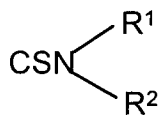
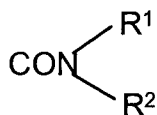
基磺醯基、鹵烷基硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、羥基、巯基、胺基、烷基羰胺基、鹵烷基羰胺基、苯甲醯基胺基、烷氧基-羰胺基、鹵烷氧羰胺基、烷基磺醯基胺基或鹵烷基磺醯基胺基；

5 R 代表烷基或鹵烷基；

m 代表 0、1、2、3、4 或 5；

n 代表 1、2、3 或 4；

G 係選自下述組群



式中

10 R^1 與 R^2 各自獨立地代表氫；視需要經取代之烷基、烯基、炔基、環烷基或烷基磺醯基；鹵烷基磺醯基或 $\text{CH}_2\text{-R}^7$ ；或一起結合代表 C_{2-6} 伸烷基；

R^3 與 R^4 各自獨立地代表氫；氫基；視需要經取代之烷基、烯基、炔基、環烷基；或一起結合代表 C_{2-6} 伸烷基；

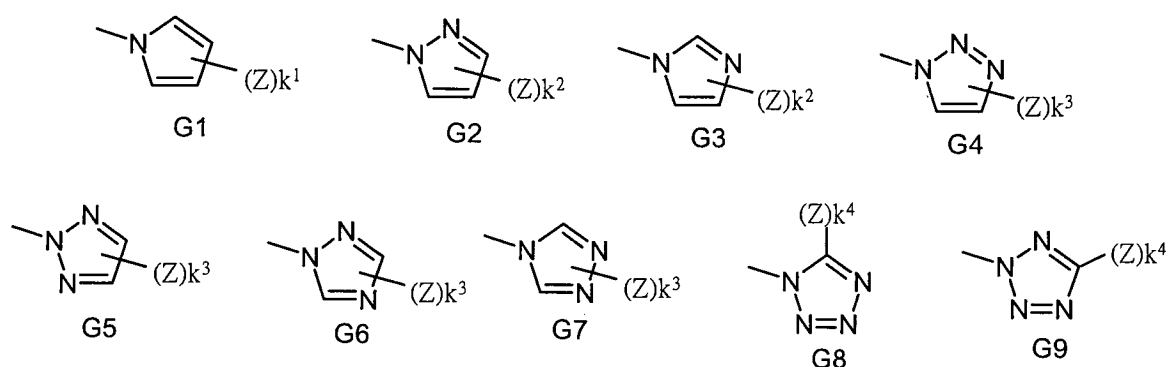
15 l 代表 1、2 或 3；

R^5 代表氫；烷基；視需要經取代之環烷基；鹵烷基；氫基；烯基；炔基；烷羰基或 $\text{CH}_2\text{-R}^7$ ；

R^6 代表甲醯基、氫基、烷羰基、烷基硫羰基、鹵烷基羰基、鹵烷基硫羰基、烷胺羰基、烷胺基硫羰基、二烷胺羰基、二烷胺基硫羰基、烷氧胺羰基、烷氧胺基硫

羰基、烷氧羰基、烷氧硫羰基、硫基烷氧羰基、硫基
 烷氧硫羰基、 CO-R^7 、 CS-R^7 、烷基磺醯基或鹵烷基磺
 醯基；或替代地

5 R^5 與 R^6 於和與彼等連接之氮一起結合形成含有至少一個
 N 原子及視需要之選自 S 與 O 之至少一個另外雜原子
 之 3 至 6 員環，其中該環視需要被酮基或硫酮基取代；
 或由雜環 G1 至 G9 構成之基團：



10 Z 可相同或不同，代表鹵素、鹵烷基、硝基、烷基、烷
 氧基、氰基、鹵烷氧基、烷基磺醯基、鹵烷基磺醯基、
 羥基或巰基；

k^1 代表 0、1、2、3 或 4；

k^2 代表 0、1、2 或 3；

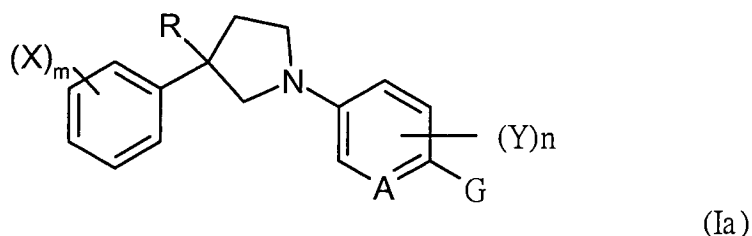
k^3 代表 0、1 或 2；

15 k^4 代表 0 或 1；

R^7 代表苯基或雜環，彼等視需要被選自鹵素與 C_{1-6} 烷基
 之至少一個取代基取代；及

A 代表 C 或 N。

20 於本發明式(I)化合物中，較佳之化合物為具式(Ia)之
 化合物



式中 X、Y、R、A、G、Y、n 與 m 如上文所界定。

於本發明式(I)或式(Ia)化合物中，進一步較佳之化

5 物為其中

X 可相同或不同，代表鹵素、C₁₋₆ 鹵烷基、硝基、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 烷氧基、氰基、C₁₋₆ 鹵烷氧基、C₁₋₆ 烷硫基、C₁₋₆ 烷基亞磺醯基、C₁₋₆ 烷基磺醯基、C₁₋₆ 鹵烷硫基、C₁₋₆ 鹵烷基亞磺醯基、C₁₋₆ 鹵烷基磺醯基、羥基、巰基、胺基、C₁₋₆ 烷基羰胺基、C₁₋₆ 鹵烷基羰胺基、苯甲醯基胺基、C₁₋₆ 烷氧基-羰胺基、C₁₋₆ 鹵烷氧基-羰胺基、C₁₋₆ 烷基磺醯基胺基或 C₁₋₆ 鹵烷基磺醯基胺基；

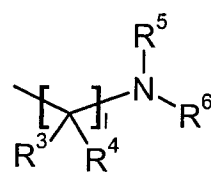
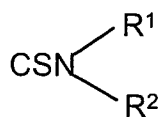
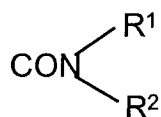
Y 可相同或不同，代表鹵素、C₁₋₆ 鹵烷基、硝基、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 烷氧基、氰基、C₁₋₆ 鹵烷氧基、C₁₋₆ 烷硫基、C₁₋₆ 烷基亞磺醯基、C₁₋₆ 烷基磺醯基、C₁₋₆ 鹵烷硫基、C₁₋₆ 鹵烷基亞磺醯基、C₁₋₆ 鹵烷基磺醯基、羥基、巰基、胺基、C₁₋₆ 烷基羰胺基、C₁₋₆ 鹵烷基羰胺基、苯甲醯基胺基、C₁₋₆ 烷氧基-羰胺基、C₁₋₆ 鹵烷氧基-羰胺基、C₁₋₆ 烷基磺醯基胺基或 C₁₋₆ 鹵烷基磺醯基胺基；

20 R 代表 C₁₋₆ 烷基或 C₁₋₆ 鹵烷基；

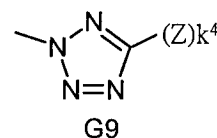
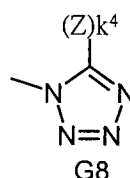
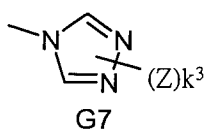
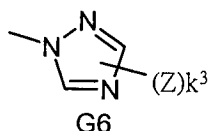
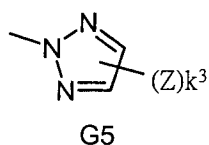
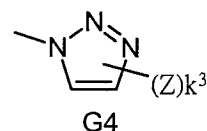
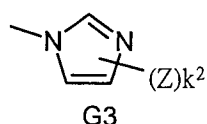
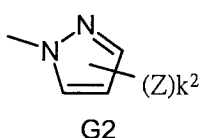
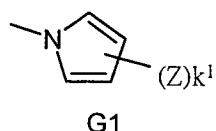
m 代表 0、1、2、3、4 或 5；

n 代表 0、1、2、或 4；

G 係選自下述組群



或由雜環 G1 至 G9 構成之基團：



式中

5 R^1 與 R^2 各自獨立地代表氫；視需要經取代之 C_{1-6} 烷基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 炔基、 C_{3-7} 環烷基； C_{1-6} 烷基磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷基磺醯基、或 $\text{CH}_2\text{-R}^7$ ；或一起結合代表 C_{2-6} 伸烷基；

10 R^3 與 R^4 各自獨立地代表氫、氰基；視需要經取代之 C_{1-6} 烷基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 炔基、 C_{3-7} 環烷基；或 C_{1-6} 烷氧羰基；或一起結合代表 C_{2-6} 伸烷基；

1 代表 1 或 2 或 3；

15 R^5 代表氫； C_{1-6} 烷基；視需要經取代之 C_{3-7} 環烷基； C_{1-6} 鹵烷基；氰基； C_{2-6} 烯基； C_{2-6} 炔基； C_{1-6} 烷羰基；或 $\text{CH}_2\text{-R}^7$ ；

R^6 代表甲醯基、氰基、 C_{1-6} 烷羰基、 C_{1-6} 烷基硫羰基、 C_{1-6} 鹵烷基-羰基、 C_{1-6} 鹵烷基硫羰基、 C_{1-6} 烷胺羰基、

C_{1-6} 烷胺基硫羰基、具有 2 至 8 個碳原子之二烷胺基-
 羰基、具有 2 至 8 個碳原子之二烷胺基硫羰基、 C_{1-6}
 烷氧胺羰基、 C_{1-6} 烷氧胺基硫羰基、 C_{1-6} 烷氧羰基、
 C_{1-6} 烷氧硫羰基、 C_{1-6} 硫基烷氧羰基、 C_{1-6} 硫基烷氧硫
 5 羰基、 $CO-R^7$ 、 $CS-R^7$ 、 C_{1-6} 烷基磺醯基、或 C_{1-6} 鹵烷
 基磺醯基；或

R^5 與 R^6 於和與彼等連接之氮一起結合形成含有至少一個
 N 原子及視需要之選自 S 與 O 之至少一個另外雜原子
 之 3 至 6 員環，其中該環視需要被酮基或硫酮基取代；

10 Z 可相同或不同，代表鹵素、 C_{1-6} 鹵烷基、硝基、 C_{1-6}
 烷基、 C_{1-6} 烷氧基、氰基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{1-6} 烷基磺
 醯基、 C_{1-6} 鹵烷基磺醯基、羥基或巰基；

k^1 代表 0、1、2、3 或 4；

k^2 代表 0、1、2 或 3；

15 k^3 代表 0 或 1；

k^4 代表 0 或 1；

R^7 代表苯基或雜環，彼等視需要被選自氟、氯、溴、碘
 與 C_{1-6} 烷基之至少一個取代基取代；及

A 代表 C 或 N 者。

20 本發明式(I)或式(Ia)之進一步較佳化合物為其中

X 可相同或不同，代表鹵素、 C_{1-6} 鹵烷基、硝基、 C_{1-6}
 烷基、 C_{1-6} 烷氧基、氰基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{1-6} 烷硫基、
 C_{1-6} 烷基亞磺醯基、 C_{1-6} 烷基磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷硫基、
 C_{1-6} 鹵烷基亞磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷基磺醯基、羥基、巰

基、胺基、 C_{1-6} 烷基羰胺基、 C_{1-6} 鹵烷基羰胺基、苯
甲醯基胺基、 C_{1-6} 烷氧基-羰胺基、 C_{1-6} 鹵烷氧基-羰胺
基、 C_{1-6} 烷基磺醯基胺基或 C_{1-6} 鹵烷基磺醯基胺基；

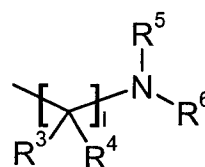
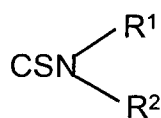
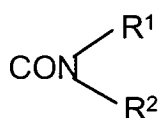
Y 可相同或不同，代表鹵素、 C_{1-6} 鹵烷基、硝基、 C_{1-6}
5 烷基、 C_{1-6} 烷氧基、氰基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{1-6} 烷硫基、
 C_{1-6} 烷基亞磺醯基、 C_{1-6} 烷基磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷硫基、
 C_{1-6} 鹵烷基亞磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷基磺醯基、羥基、巰
基、胺基、 C_{1-6} 烷基羰胺基、 C_{1-6} 鹵烷基羰胺基、苯
甲醯基胺基、 C_{1-6} 烷氧基-羰胺基、 C_{1-6} 鹵烷氧基-羰胺
10 基、 C_{1-6} 烷基磺醯基胺基或 C_{1-6} 鹵烷基磺醯基胺基；

R 代表 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 鹵烷基；

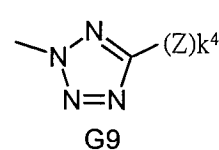
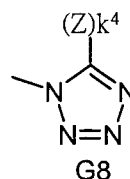
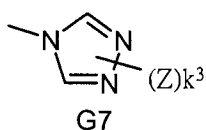
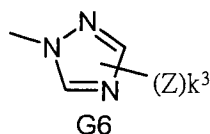
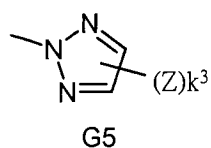
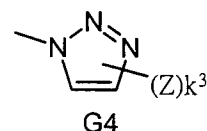
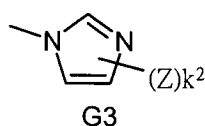
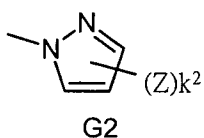
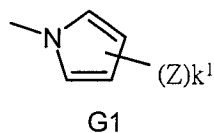
m 代表 0、1、2 或 3；

n 代表 0、1、2 或 3；

G 係選自下述組群



15 或由雜環 G1 至 G9 構成之基團：



R^1 與 R^2 各自獨立地代表氫、可經取代之 C_{1-6} 烷基、可經取代之 C_{2-6} 烯基、可經取代之 C_{2-6} 炔基、可經取代之 C_{3-7} 環烷基、 C_{1-6} 烷基磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷基磺醯基或 CH_2-R^7 ；或一起結合代表 C_{3-5} 伸烷基；

5 R^3 與 R^4 各自獨立地代表氫、氰基、可經取代之 C_{1-6} 烷基、可經取代之 C_{2-6} 烯基、可經取代之 C_{2-6} 炔基可經取代之、可經取代之 C_{3-7} 環烷基或 C_{1-6} 烷氧-羰基；或一起結合代表 C_{3-5} 伸烷基；

1 代表 1 或 2；

10 R^5 代表氫、 C_{1-6} 烷基、可經取代之 C_{3-7} 環烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、氰基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 炔基、 C_{1-6} 烷基-羰基或 CH_2-R^7 ；

R^6 代表甲醯基、氰基、 C_{1-6} 烷基-羰基、 C_{1-6} 烷硫基-羰基、 C_{1-6} 鹵烷基-羰基、 C_{1-6} 鹵烷硫基-羰基、 C_{1-6} 烷基-羰基、 C_{1-6} 烷基硫羰基、具有 2 至 8 個碳原子之二烷基-羰基、具有 2 至 8 個碳原子之二烷基硫羰基、 C_{1-6} 烷氧基-羰基、 C_{1-6} 烷氧基硫羰基、 C_{1-6} 硫基烷氧-羰基、 C_{1-6} 硫基烷氧基硫羰基、 $CO-R^7$ 、 $CS-R^7$ 、 C_{1-6} 烷基磺醯基或 C_{1-6} 鹵烷基磺醯基；或替代地

20 R^5 與 R^6 於和與彼等連接之氮一起結合形成含有至少一個 N 原子及視需要之選自 S 與 O 之至少一個另外雜原子之 3 至 6 員環，其中該環視需要被酮基或硫酮基取代；

Z 可相同或不同，代表鹵素、 C_{1-6} 鹵烷基、硝基、 C_{1-6}

烷基、 C_{1-6} 烷氧基、氰基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{1-6} 烷基磺
 醯基、 C_{1-6} 鹵烷基磺醯基、羥基或巰基；

k^1 代表 0、1、2 或 3；

k^2 代表 0、1 或 2；

5 k^3 代表 0 或 1；

k^4 代表 0 或 1；

R^7 代表苯基或雜環，彼等視需要被選自氟、氯、溴、與
 C_{1-6} 烷基之至少一個取代基取代；及

A 代表 C 或 N 之該等化合物。

10 於式(I)或式(Ia)彼等化合物中，特佳者為其中

X 可相同或不同，代表鹵素、 C_{1-4} 鹵烷基、硝基、 C_{1-4}
 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、氰基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、
 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、 C_{1-4} 鹵烷硫基、
 C_{1-4} 鹵烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 鹵烷基磺醯基、羥基、巰
 15 基、胺基、 C_{1-4} 烷基-羰胺基、 C_{1-4} 鹵烷基羰胺基、苯
 甲醯基胺基、 C_{1-4} 烷氧羰胺基、 C_{1-4} 鹵烷氧基-羰胺基、
 C_{1-4} 烷基磺醯基胺基或 C_{1-4} 鹵烷基磺醯基胺基；

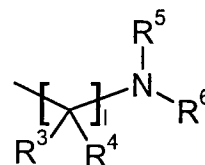
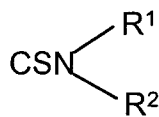
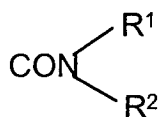
Y 可相同或不同，代表鹵素、 C_{1-4} 鹵烷基、硝基、 C_{1-4}
 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、氰基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、
 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、 C_{1-4} 鹵烷硫基、
 C_{1-4} 鹵烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 鹵烷基磺醯基、羥基、巰
 20 基、胺基、 C_{1-4} 烷基-羰胺基、 C_{1-4} 鹵烷基羰胺基、苯
 甲醯基胺基、 C_{1-4} 烷氧基-羰胺基、 C_{1-4} 鹵烷氧基-羰胺
 基、 C_{1-4} 烷基磺醯基胺基或 C_{1-4} 鹵烷基磺醯基胺基；

R 代表 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基；

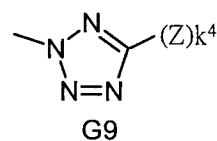
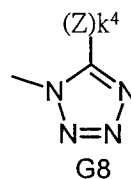
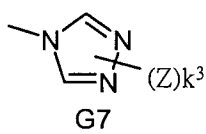
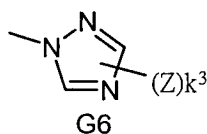
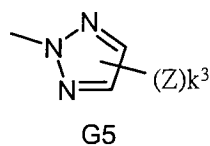
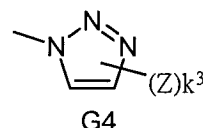
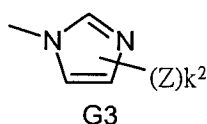
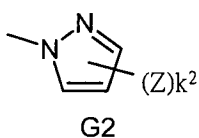
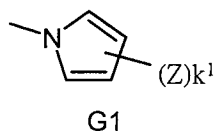
m 代表 0、1、2 或 3；

n 代表 0、1、2 或 3；

G 係選自下述組群



5 或由雜環 G1 至 G9 構成之基團：



R^1 與 R^2 各自獨立地代表氫、可經取代之 C_{1-4} 烷基、可經取代之 C_{2-4} 烯基、可經取代之 C_{2-4} 炔基、可經取代之 C_{3-6} 環烷基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、 C_{1-4} 鹵烷基磺醯基、或 CH_2-R^7 ；或一起結合代表 C_{3-5} 伸烷基；

R^3 與 R^4 各自獨立地代表氫、氟基、可經取代之 C_{1-4} 烷基、可經取代之 C_{2-4} 烯基、可經取代之 C_{2-4} 炔基、可經取代之 C_{3-6} 環烷基或 C_{1-4} 烷氧-羰基；或一起結合代表 C_{3-5} 伸烷基；

15 1 代表 1 或 2；

R^5 代表氫、 C_{1-4} 烷基、可經取代之 C_{3-6} 環烷基、 C_{1-4} 鹵烷基、氟基、 C_{2-4} 烯基、 C_{2-4} 炔基、 C_{1-4} 烷基-羰基或

$\text{CH}_2\text{-R}^7$;

- R^6 代表甲醯基、氰基、 C_{1-4} 烷基-羰基、 C_{1-4} 烷硫基-羰基、 C_{1-4} 鹵烷基-羰基、 C_{1-4} 鹵烷基硫羰基、 C_{1-4} 烷基胺基-羰基、 C_{1-4} 烷基胺基硫羰基、具有 2 至 8 個碳原子之二烷基胺基-羰基、具有 2 至 8 個碳原子之二烷基胺基硫羰基、 C_{1-4} 烷氧胺基-羰基、 C_{1-4} 烷氧胺基硫羰基、 C_{1-4} 烷氧-羰基、 C_{1-4} 烷氧基硫羰基、 C_{1-4} 硫基烷氧-羰基、 C_{1-4} 硫基烷氧基硫羰基、 CO-R^7 、 CS-R^7 、 C_{1-4} 烷基磺醯基、或 C_{1-4} 鹵烷基磺醯基；或替代地
- 5 R^5 與 R^6 於和與彼等連接之氮一起結合形成含有至少一個 N 原子及視需要之選自 S 與 O 之至少一個另外雜原子之 3 至 6 員環，其中該環視需要被酮基或硫酮基取代；
- Z 可相同或不同，代表鹵素、 C_{1-4} 鹵烷基、硝基、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、氰基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、 C_{1-4} 鹵烷基磺醯基、羥基或巰基；
- 15 k^1 代表 0、1、2 或 3；
- k^2 代表 0、1 或 2；
- k^3 代表 0 或 1；
- k^4 代表 0 或 1；
- 20 R^7 代表苯基或雜環，彼等視需要被選自氟、氯、溴、與 C_{1-4} 烷基之至少一個取代基取代之化合物。

於本發明之一具體實例中，式(I)或式(Ia)化合物係其中

X 可相同或不同，代表氟、氯、溴、三氟甲基、二氟甲

- 基、氟甲基、硝基、甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、第三丁基、2-甲基-丙基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、第三丁氧基、2-甲基-丙氧基、氰基、三氟甲氧基、二氟甲氧基、氟甲氧基、硫
- 5 甲基、硫乙基、硫丙基、硫基-異丙基、硫丁基、硫基-第三丁基、2-甲基-硫丙基、甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、丙基亞磺醯基、異丙基亞磺醯基、丁基亞磺醯基、第三丁基亞磺醯基、2-甲基-丙基亞磺醯基、甲基磺醯基、乙基磺醯基、丙基磺醯基、異丙基磺醯基、
- 10 丁基磺醯基、第三丁基磺醯基、2-甲基-丙基磺醯基、三氟甲基硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺醯基、羥基、巯基、胺基、甲基羰胺基、乙基羰胺基、丙基羰胺基、異丙基羰胺基、丁基羰胺基、第三丁基羰胺基、2-甲基-丙基羰胺基、苯甲醯基胺基、甲氧-羰胺基、乙氧-羰胺基、丙氧-羰胺基、異丙氧-羰胺基、丁
- 15 氧-羰胺基、第三丁氧-羰胺基、2-甲基-丙氧-羰胺基、三氟甲氧羰胺基、 C_{1-4} 烷基磺醯基胺基或 C_{1-4} 鹵烷基磺醯基胺基；
- Y 可相同或不同，代表氟、氯、溴、碘、三氟甲基、二
- 20 氟甲基、氟甲基、硝基、甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、第三丁基、2-甲基-丙基、甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、第三丁氧基、2-甲基-丙氧基、氰基、三氟甲氧基、二氟甲氧基、氟甲氧基、硫甲基、硫乙基、硫丙基、硫基-異丙基、硫丁基、硫

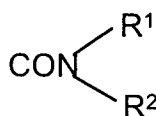
基-第三丁基、2-甲基-硫丙基、甲基亞磺醯基、乙基
 亞磺醯基、丙基亞磺醯基、異丙基亞磺醯基、丁基亞
 磺醯基、第三丁基亞磺醯基、2-甲基-丙基亞磺醯基、
 甲基磺醯基、乙基磺醯基、丙基磺醯基、異丙基磺醯
 5 基、丁基磺醯基、第三丁基磺醯基、2-甲基-丙基磺醯
 基、三氟甲基硫基、三氟甲基亞磺醯基、三氟甲基磺
 醯基、羥基、巰基、胺基、三氟甲基羰胺基、甲基羰
 胺基、乙基羰胺基、丙基羰胺基、異丙基羰胺基、丁
 基羰胺基、第三丁基羰胺基、2-甲基-丙基羰胺基、
 10 2,2,2,-三氟乙基羰胺基、苯甲醯基胺基、甲氧-羰胺
 基、乙氧-羰胺基、丙氧-羰胺基、異丙氧-羰胺基、丁
 氧-羰胺基、第三丁氧-羰胺基、2-甲基-丙氧-羰胺基、
 三氟甲氧羰胺基、 C_{1-4} 烷基磺醯基胺基或 C_{1-4} 鹵烷基
 磺醯基胺基；

15 R 代表甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、第三丁基、
 2-甲基-丙基或三氟甲基、二氟甲基、氟甲基；

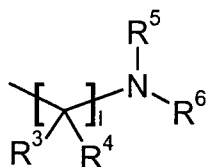
m 代表 0、1、2 或 3；

n 代表 0、1、2 或 3；

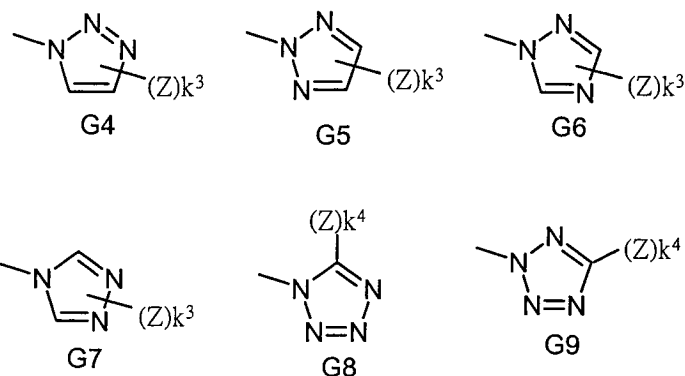
G 代表：



或



或替代地代表下述 G1 至 G9 雜環：



R^1 與 R^2 各自獨立地代表氫、可經取代之 C_{1-4} 烷基、可經取代之 C_{2-4} 烯基、可經取代之 C_{2-4} 炔基、可經取代之 C_{3-6} 環烷基、 C_{1-4} 烷基磺醯基、 C_{1-4} 鹵烷基磺醯基或 CH_2-R^7 ；或一起結合代表 C_{3-5} 伸烷基；

R^3 與 R^4 各自獨立地代表氫、氰基、可經取代之 C_{1-4} 烷基、可經取代之 C_{2-4} 烯基、可經取代之 C_{2-4} 炔基、可經取代之 C_{3-6} 環烷基或 C_{1-4} 烷氧-羰基；或一起結合代表 C_{3-5} 伸烷基；

1 代表 1 或 2；

R^5 代表氫、 C_{1-4} 烷基、可經取代之 C_{3-6} 環烷基、 C_{1-4} 鹵烷基、氰基、 C_{2-4} 烯基、 C_{2-4} 炔基、 C_{1-4} 烷基-羰基或 CH_2-R^7 ；

15 R^6 代表甲醯基、氰基、 C_{1-4} 烷基-羰基、 C_{1-4} 烷硫基-羰基、 C_{1-4} 鹵烷基-羰基、 C_{1-4} 鹵烷硫基-羰基、 C_{1-4} 烷胺基-羰基、 C_{1-4} 烷胺基硫羰基、具有 2 至 6 個碳原子之二烷胺基-羰基、具有 2 至 6 個碳原子之二烷胺基硫羰基、 C_{1-4} 烷氧胺基-羰基、 C_{1-4} 烷氧胺基硫羰基、 C_{1-4} 烷氧-羰基、 C_{1-4} 烷氧基硫羰基、 C_{1-4} 硫基烷氧-羰基、

C_{1-4} 硫基烷氧基硫羰基、 $CO-R^7$ 、 $CS-R^7$ 、 C_{1-4} 烷基磺
 醯基、或 C_{1-4} 鹵烷基磺醯基；或替代地

Z 可相同或不同，代表氯、溴或碘、三氟甲基、硝基、
 甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、第三丁基、2-甲
 5 基-丙基、氰基；

k^3 代表 0 或 1；

k^4 代表 0 或 1；

R^7 代表可經取代之苯基或選自包括吡啶基、吡咯烷基、
 咪唑基、三唑基、喹二唑基、四唑基、嘧啶基、與可
 10 經取代之三吡基之組群之雜環，其中該取代基係選自
 氯、溴、碘及甲基、乙基、異丙基、正丙基、2-甲基
 丙基、正丁基與第三丁基之至少一者；及

A 代表 C 之化合物。

15 本發明之式(I)或式(Ia)化合物具有不對稱碳，因而涵
 蓋光學異構物。

本文所用之「烷基」係指直鏈或分支鏈 C_{1-12} 烷基例如
 甲基、乙基、正-或異丙基、正-、異-、第二-、或第三丁基、
 正戊基、正己基、正庚基、正辛基、正壬基、正癸基、正
 十一基、正十二基等，較佳係指 C_{1-6} 烷基。

20 本文所用之「鹵烷基」係指具有 1 至 12 個碳原子，較
 佳為 1 至 6 個或 1 至 4 個碳原子之烷基基團，其中至少一
 個氫原子被鹵素置換；適當鹵烷基為例如 CH_2F 、 CHF_2 、
 CF_3 、 CF_2Cl 、 $CFC1_2$ 、 CF_2Br 、 CF_2CF_3 、 $CFHCF_3$ 、 CH_2CF_3 、
 $CFC1CF_3$ 、 $CC1_2CF_3$ 、 CF_2CH_3 、 CF_2CH_2F 、 CF_2CHF_2 、

CF₂CF₂Cl、CF₂CF₂Br、CFHCH₃、CFHCH₂F、CFHCHF₂、
 CHF₂CF₃、CHF₂CF₂Cl、CHF₂CF₂Br、CH₂CF₃、CFC₁CF₃、
 CC₁₂CF₃、CF₂CF₂CF₃、CH₂CF₂CF₃、CF₂CH₂CF₃、
 CF₂CF₂CH₃、CHF₂CF₂CF₃、CF₂CHF₂CF₃、CF₂CF₂CHF₂、
 5 CF₂CF₂CH₂F、CF₂CF₂CF₂Cl、CF₂CF₂CF₂Br；該鹵烷基
 基團可被至少一個適當取代基取代。

本文所用之「烷氧基」係指具有 1 至 12 個碳原子，較
 佳為 1 至 6 個或 1 至 4 個碳原子之烷氧基基團；適當烷氧
 基基團為例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正-、
 10 異-、第二-或第三丁氧基、戊氧基、或己氧基；該烷氧基
 基團可被至少一個適當取代基取代。

具有烷基為其結構一部分之各基團中之各烷基部分可
 附加地以如上文「烷基」所述相同者予以說明。

「醯基胺基」代表，例如，烷基羧胺基、環丙基羧胺
 15 基與苯甲醯基胺基，其中烷基部分可附加地以如上文「烷
 基」所述相同者予以說明。

「鹵素」及被鹵素取代之各基團中之各鹵素部分係指
 氟、氯、溴與碘，較佳係指氟、氯或溴。

「環烷基」係指 C₃₋₈ 環烷基例如環丙基、環丁基、環
 20 戊基、環己基、環庚基、環辛基；較佳係指 C₃₋₇ 環烷基。

「烯基」係指 C₂₋₅ 烯基例如乙烯基、烯丙基、1-丙烯
 基、1-(或 2-或 3-)丁烯基、1-戊烯基；較佳係指 C₂₋₄ 烯基。

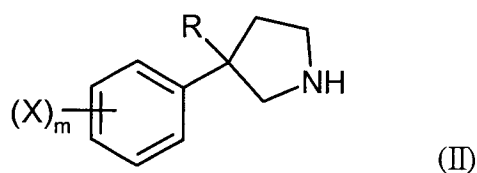
「炔基」係指 C₂₋₅ 炔基例如乙炔基、炔丙基、1-丙炔
 基、丁-3-炔基、戊-4-炔基等；較佳係指 C₂₋₄ 炔基。

「雜環基」係指含有選自 N、O 或 S 之至少一個雜原子之 5 或 6 員雜環基團，其中該環亦係指可為苯并稠合之稠合雜環基團。

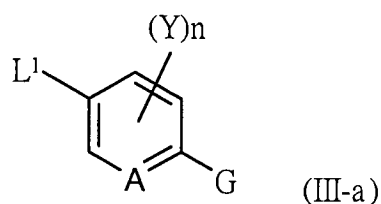
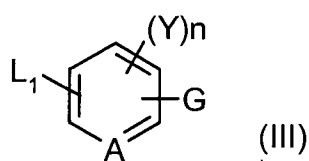
5 雜環基團為例如呋喃基、噻吩基、吡咯基、異噁唑基、吡唑基、噁唑基、噁噻唑基、咪唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基、吡啶基、吡咯烷基、嘧啶基、嗒吡基、吡嗪基、三吡基、吡啶基、苯并噁唑基、喹啉基等。

本發明之式(I)或式(Ia)化合物舉例而言，可利用下述方法(a)至(j)予以製備。

10 製法(a)包括使式(II)化合物



式中 X、R 與 m 具有如本文界定之相同意義，與式(III)或式(III-a)化合物反應



式中

15 Y、A、G 與 n 具有如本文界定之相同意義，

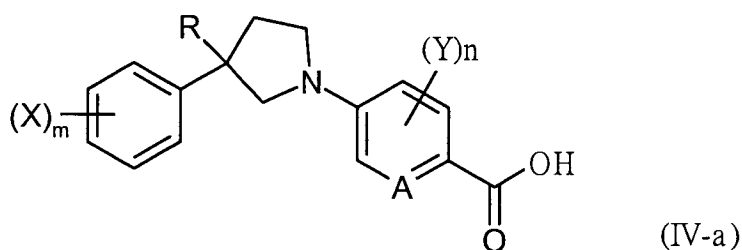
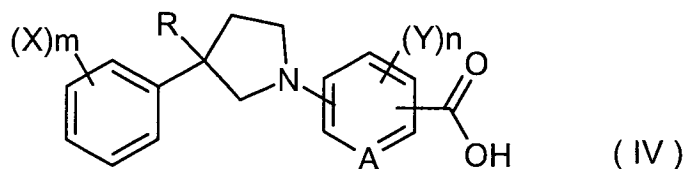
L^1 代表鹵素或 C_1 - C_4 鹵烷基磺醯基氧基。

於製法(a)之具體實例中，式(II)與式(III)或式(III-a)化合物係於鹼存在下或於至少一種金屬觸媒存在下進行反

應。

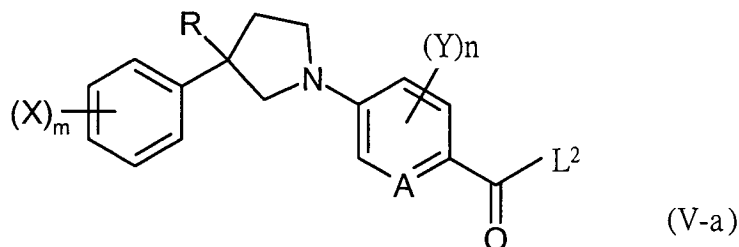
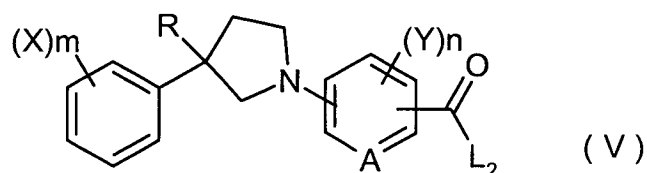
製法(b)及(c)係用於製備根據式(I)或式(Ia)中 G 代表 $-\text{CONR}^1\text{R}^2$ 基團之化合物：

方法(b)包括使式(IV)或式(IV-a)所示化合物

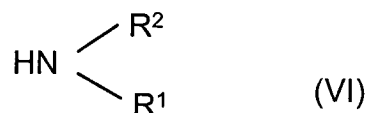


式中 X、Y、R、A、m 與 n 具有如本文界定之相同意義，
或

使式(V)或式(V-a)所示化合物

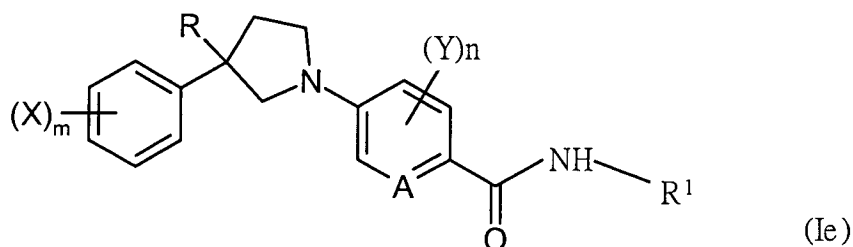
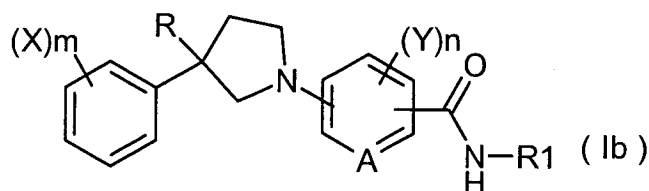


式中 X、Y、R、A、m 與 n 具有如本文界定之相同意義及 L^2 代表氯、溴、 C_{1-4} 烷基羰氧基、 C_{1-4} 烷氧羰氧基或唑基，
與式(VI)所示化合物：



式中 R^1 與 R^2 具有如本文界定之相同意義，使用縮合劑，需要時，於鹼存在下，進行反應。

方法(c)包括使式(Ib)或式(Ie)所示化合物：



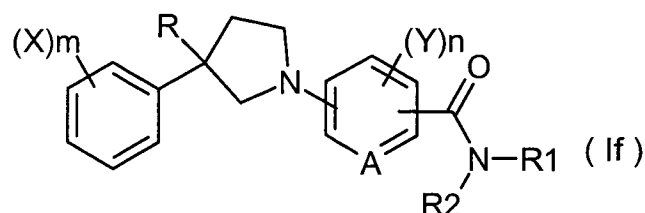
式中 X、Y、R、 R^1 、A、m 與 n 具有如本文界定之相同意義，

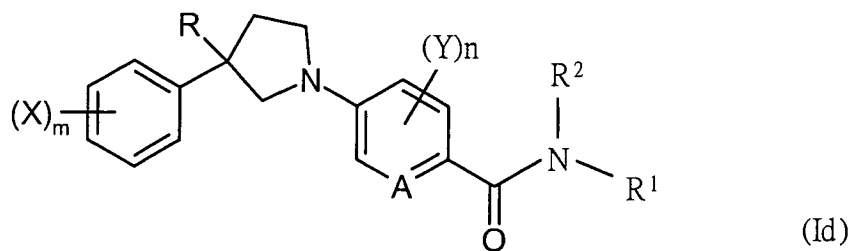
與下式所示化合物：

- 10 $\text{R}^2\text{-L}^3$ (VII)，式中 R^2 具有如本文界定之相同意義及 L^3 代表氯、溴、碘、 C_{1-4} 烷基磺醯氧基、 C_{1-4} 鹵烷基磺醯氧基、芳基磺醯氧基或唑基，需要時，於鹼存在下，進行反應。

製法(d)係用於製備根據式(I)或式(Ia)中 G 代表 $\text{-CSNR}^1\text{R}^2$ 基團之化合物：

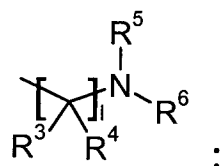
- 15 方法(d)包括使式(If)或式(Id)所示化合物：



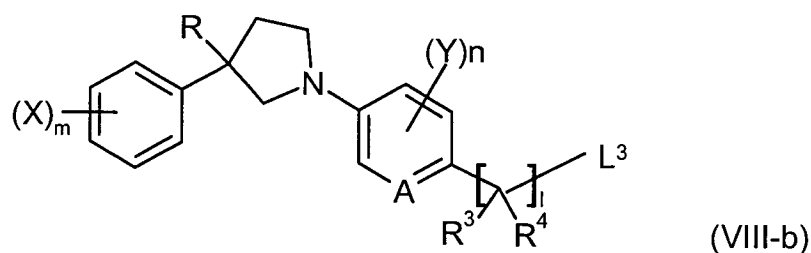
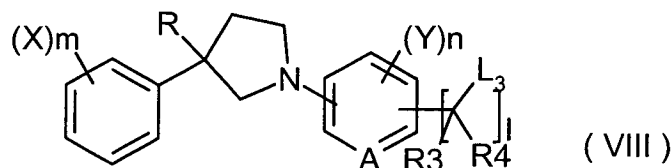


式中 X、Y、R、R¹、R²、A、m 與 n 具有如本文界定之相同意義，與硫酸化劑反應。

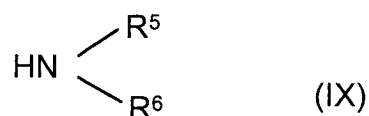
製法(e)、(f)及(g)係用於製備根據式(I)或式(Ia)之化合物中，G 代表下式者



方法(e)包括使式(VIII)或式(VIII-b)所示化合物：



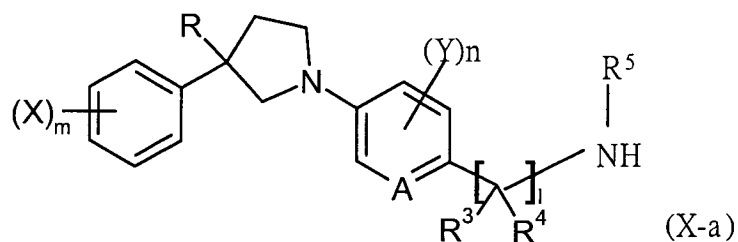
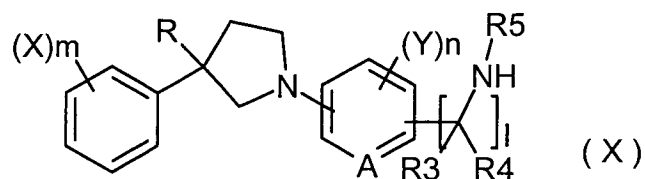
10 式中 X、Y、R、R³、R⁴、A、l、m、n 與 L³ 具有如本文界定之相同意義與式(IX)所示化合物：



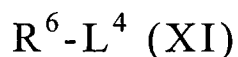
式中 R⁵ 與 R⁶ 具有如本文界定之相同意義，需要時，於鹼

存在下，進行反應。

方法(f)包括使式(X)或式(X-a)所示化合物：

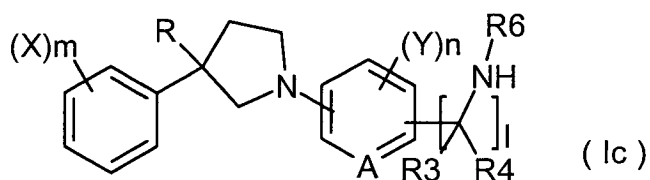


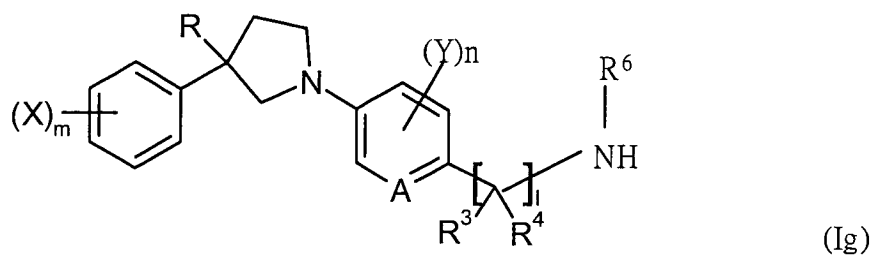
5 式中 X、Y、R、R³、R⁴、R⁵、A、l、m 與 n 具有如本文界定之意義，與下式所示化合物：



式中 R⁶ 具有如本文界定之相同意義及 L⁴ 代表氟、氯、溴、C₁₋₄ 烷基-羰氧基、C₁₋₄ 烷氧-羰氧基、唑基、C₁₋₄ 烷基磺醯
 10 氧基、C₁₋₄ 鹵烷基磺醯氧基、芳基磺醯氧基，需要時，於鹼存在下，進行反應。

方法(g)包括使式(Ic)或式(Ig)所示化合物：





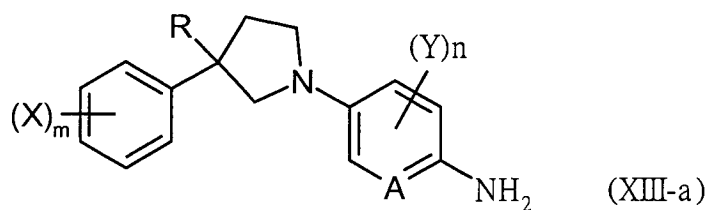
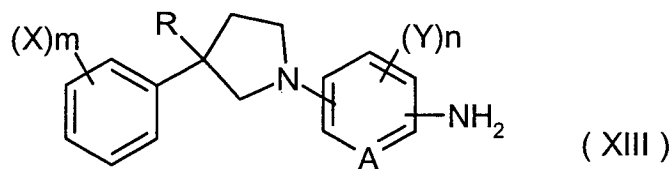
式中 X、Y、R、R³、R⁴、R⁶、A、l、m 與 n 具有如本文界定之相同意義，與下式所示化合物

R⁵-L⁴ (XII)，

- 5 式中 R⁵ 與 L⁴ 具有如本文界定之相同意義，需要時，於鹼存在下，進行反應。

製法(h)係用於製備根據式(I)或式(Ia)中 G 代表 G1、G6 或 G8 之化合物：

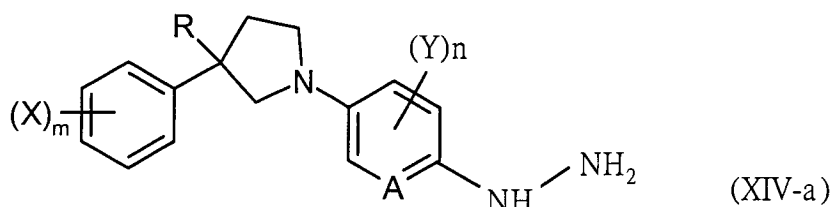
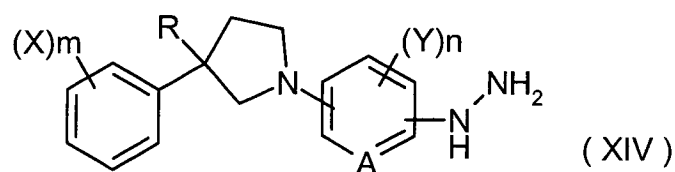
方法(h)包括使(XIII)或式(XIII-a)所示化合物：



式中 X、Y、A、m 與 n 具有如本文界定之相同意義，與二烷氧基四氫呋喃、1,2-二甲鹽基肼或疊氮化鈉及三烷基原甲酸酯反應。

- 15 製法(i)係用於製備根據式(I)或式(Ia)中 G 代表 G2 之化合物：

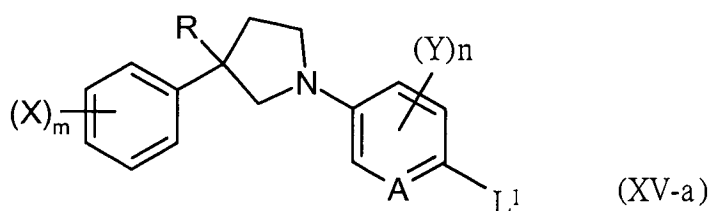
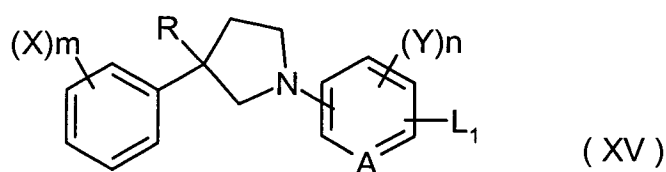
方法(i)包括使式(XIV)或式(XIV-a)所示化合物



式 中 X、Y、A、m 與 n 具有如本文界定之相同意義，與 1,1,3,3-四烷氧丙烷反應。

製法(j)係用於製備根據式(I)或式(Ia)中 G 代表 G2、G3、G4、G5、G6、G8 或 G9 之化合物：

方法(j)包括使式(XV)或式(XV-a)所示化合物：



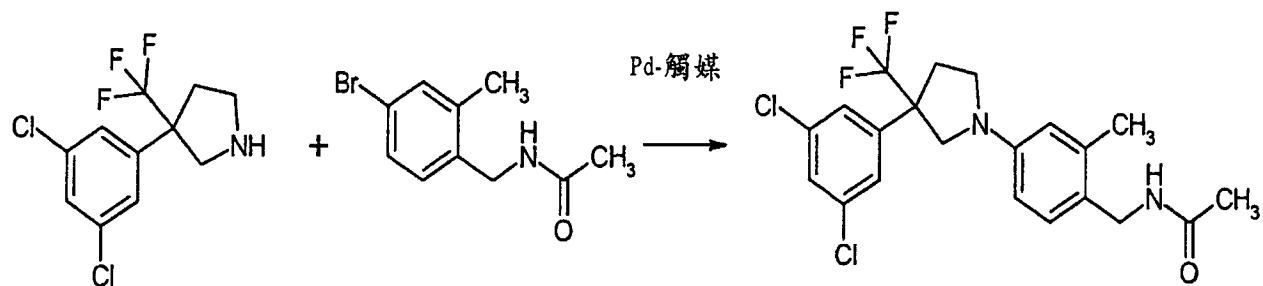
式 中 X、Y、R、A、m、n 與 L^1 具有如本文界定之相同意義，與 G2、G3、G4、G5、G6、G8 或 G9 之質子化基團，亦即 G2-H、G3-H、G4-H、G5-H、G6-H 或 G8-H 反應。

根據本發明，上述式(I)或式(Ia)之芳基吡咯烷展現強

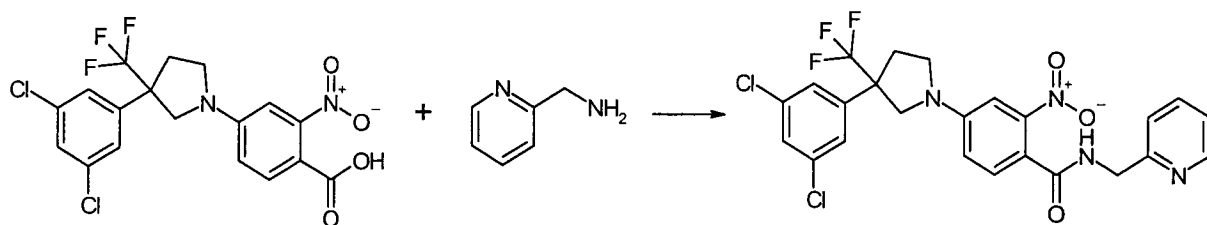
效之殺昆蟲作用。

上述製法(a)，於使用例如 3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷及 N-(4-溴-2-甲基苄基)乙醯胺作為起始物質時，可由下述反應式表示。

5

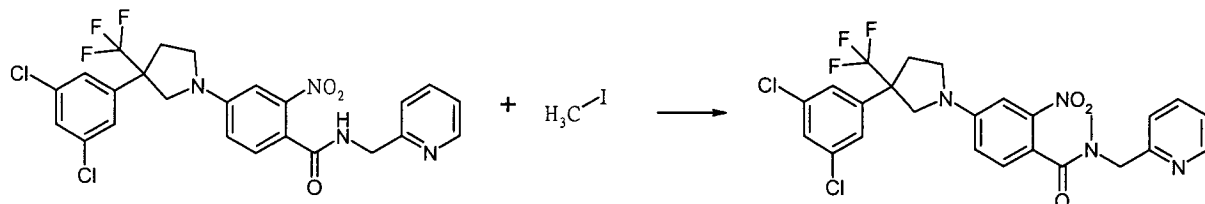


上述製法(b)，於使用例如 4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-硝基苯甲酸及 2-吡啶基甲胺作為起始物質時，可由下述反應式表示。



10

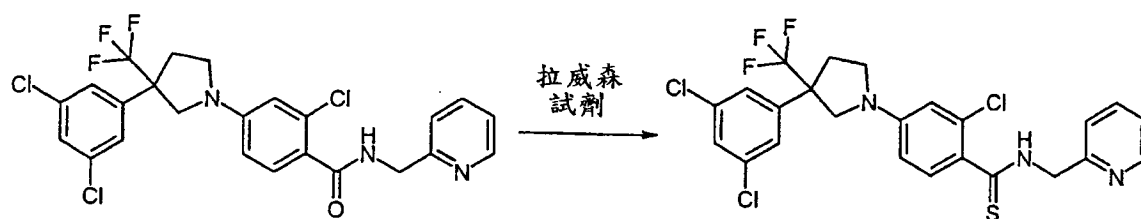
上述製法(c)，於使用例如 4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-硝基-N-(吡啶-2-基-甲基)苯甲醯胺及碘甲烷作為起始物質時，可由下述反應式表示。



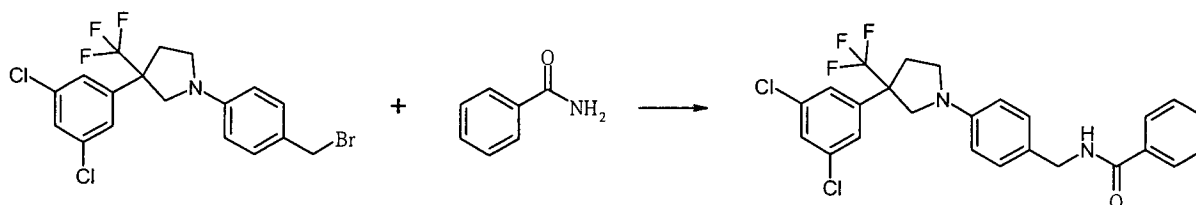
15

上述製法(d)，於使用例如 2-氯-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-N-(吡啶-2-基-甲基)苯甲醯胺及拉威森(Lawesson)試劑作為起始物質時，可由下述反

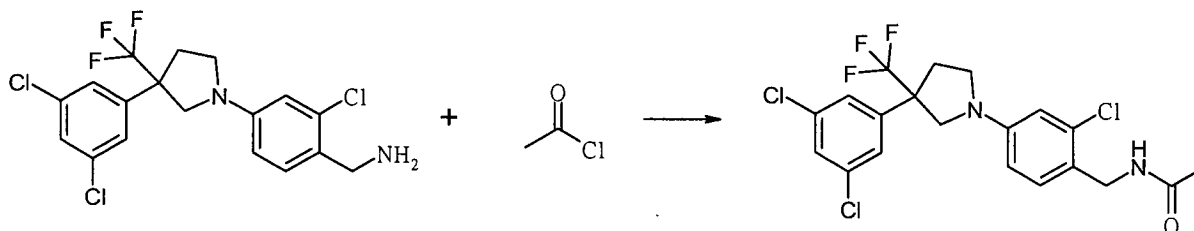
應式表示。



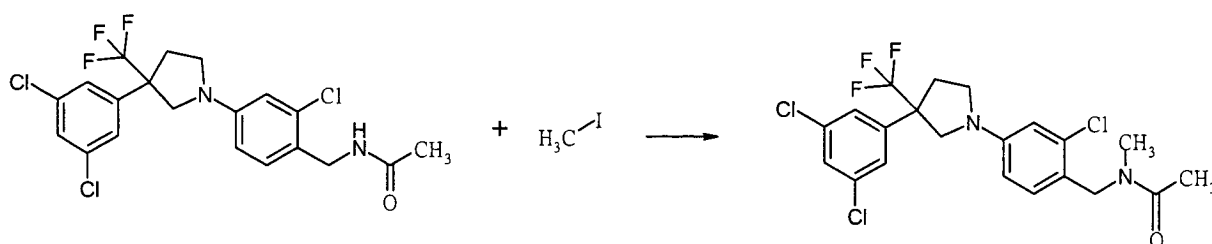
上述製法(e)，於使用例如 1-[4-(溴甲基)苯基]-3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷及苯甲醯胺作為起始物質 5 時，可由下述反應式表示。



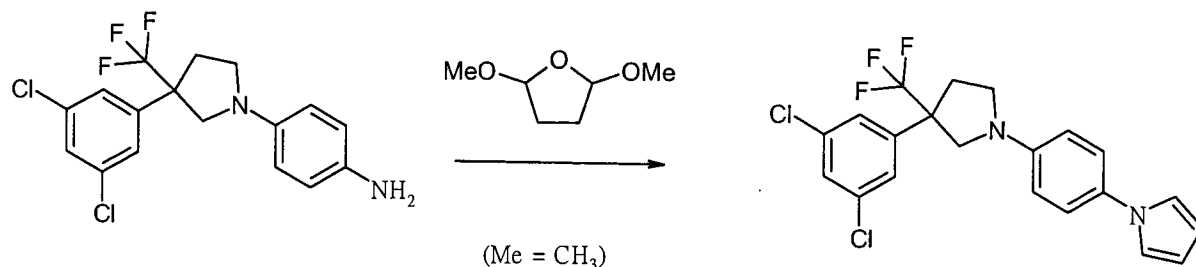
上述製法(f)，於使用例如 1-{2-氯-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苯基}甲胺及乙醯氯作為起始物質時，可由下述反應式表示。



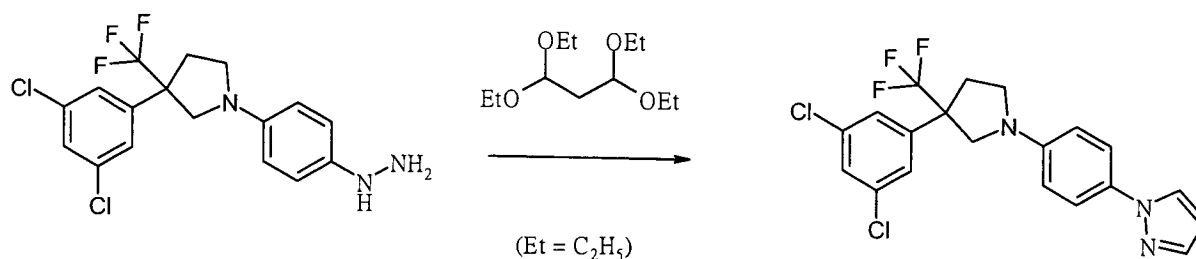
上述製法(g)，於使用例如 N-{2-氯-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苄基}乙醯胺及碘甲烷作為起始物質時，可由下述反應式表示。



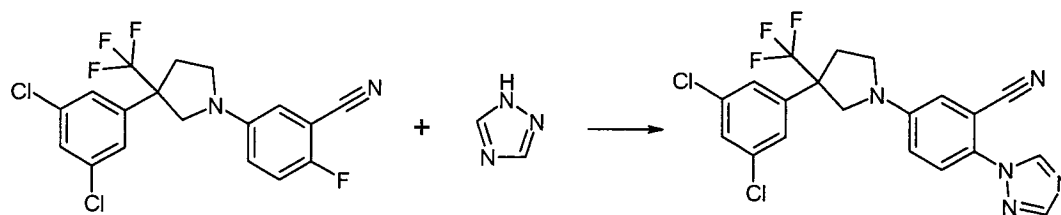
上述製法(h)，於使用例如 4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苯胺及 2,5-二甲氧四氫呋喃作為起始物質時，可由下述反應式表示。



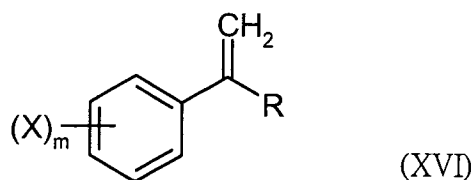
5 上述製法(i)，於使用例如 3-(3,5-二氯苯基)-1-(4-肼苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷及 1,1,3,3-四乙氧丙烷作為起始物質時，可由下述反應式表示。



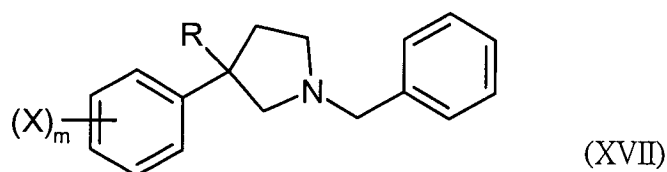
10 上述製法(j)，於使用例如 5-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-氟苯甲腈及 1H-1,2,4-三唑作為起始物質時，可由下述反應式表示。



為製法(a)起始物質之許多式(II)化合物係新穎化合物，可利用下述方法合成。使式(XVI)所示化合物：



式中 X、m 與 R 具有如本文界定之相同意義，與例如 N-苄基-1-甲氧-N-[(三甲基矽烷基)甲基]甲胺於觸媒存在下反應，獲得下式(XVII)所示化合物：



式中 X、m 與 R 具有如本文界定之相同意義，然後使其脫苄基化，獲得式(II)化合物。

具式(XVI)之已知化合物舉例而言見述於"The Journal of Organic Chemistry, 1991, vol.56, pp.7336-7340"；"The Journal of Organic Chemistry, 1994, vol.59, pp.2898-2901"；"Journal of Fluorine Chemistry, 1999, vol.95, pp.167-170"；"WO2005/05085216A"。該等化合物亦可利用彼等文獻中敘述之方法合成。

式(XVI)之代表性實例包括[1-(三氟甲基)乙烯基]苯；
 1-氯-3-[1-(三氟甲基)乙烯基]苯；1-溴-3-[1-(三氟甲基)乙烯基]苯；1-硝基-3-[1-(三氟甲基)乙烯基]苯；1-三氟甲基-3-[1-(三氟甲基)乙烯基]苯；1,3-二氟-5-[1-(三氟甲基)乙烯基]苯；1,3-二氯-5-[1-(三氟甲基)乙烯基]苯；1,3-二氟-5-[1-(三氟甲基)乙烯基]苯；1-氟-2-(三氟甲基)-4-[1-(三氟甲基)乙烯基]苯；1,2,3-三氯-5-[1-(三氟甲基)乙烯基]苯；

或 1,3-二甲基-2-硝基-5-[1-(三氟甲基)乙烯基]苯。

上述反應中，可使用 N-苄基-1-丁氧基-N-[(三甲基矽烷基)甲基]甲胺或 N-(丁氧甲基)-N-[(三甲基矽烷基)甲基]環己胺代替 N-苄基-1-甲氧基-N-[(三甲基矽烷基)甲基]甲胺；彼等為一般悉知之化合物。

上述反應所用觸媒包括三氟乙酸、三甲基矽烷基三氟甲磺酸酯、碘三甲基矽烷、氟化鉍等。

上述反應可根據"Chemistry Letters, 1984, 1117-1120"及"Tetrahedron Letters, 1993,34,3279-3282"中敘述之方法進行，其脫保護反應(例如脫苄基反應)可根據"Journal of the Organic Chemistry, 1984,49,2081"及"PROTECTIVE GROUPS in ORGANIC CHEMISTRY THIRD EDITION, JOHN WILEY & SONS,INC"中敘述之方法進行。

製法(a)中式(II)化合物之代表性實例包括：3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷；3-[3,5-雙(三氟甲基)苯基]-3-(三氟甲基)吡咯烷；3-(3,4,5-三氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷；3-(3,5-二甲基-4-硝基)-3-(三氟甲基)吡咯烷。

為製法(a)起始物質之許多式(III)或式(III-a)化合物係已知化合物，可利用有機化學中悉知之方法合成。

式(III)與式(III-a)化合物之代表性實例分別包括：N-(4-溴苄基)乙醯胺、N-(4-碘苄基)乙醯胺。

製法(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)、(g)、(h)、(i)及(j)之反應可於適當稀釋劑例如脂族烴(例如己烷、環己烷、庚烷等)、脂族鹵化烴(例如二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二

氯乙烷)、芳族烴(例如苯、甲苯、二甲苯、氯苯等)、醚類(例如二乙醚、二丁醚、二甲氧乙烷(DME)、四氫呋喃、二噁烷等)、酯類(例如乙酸乙酯、丙酸乙酯等)、醯胺類(例如二甲基甲醯胺(DMF)、二甲基乙醯胺(DMA)、N-甲基吡咯烷酮等)、腈類(例如乙腈、丙腈等)、二甲亞砜(DMSO)、水或其混合溶劑中進行。

製法(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)、(g)、(h)、(i)及(j)之反應可使用下述鹼例如鹼金屬鹼(例如氫化鋰、氫化鈉、氫化鉀、丁基鋰、第三丁基鋰、三甲基矽烷基鋰、六甲基二矽烷基胺化鋰、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸銨、磷酸三鉀、乙酸鈉、乙酸鉀、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鈉與第三丁醇鉀等)、有機鹼(例如三乙胺、二異丙基乙胺、三丁胺、N-甲基嗎啉、N,N-二甲基苯胺、N,N-二乙基苯胺、4-第三丁基-N,N-二甲基苯胺、吡啶、甲基吡啶、二甲基吡啶、二吡雙環十一烯、二吡雙環辛烷、咪唑等)。

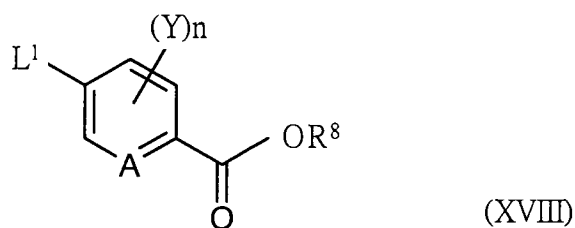
製法(a)、(b)、(c)、(d)、(e)、(f)、(g)、(h)、(i)及(j)可於寬廣溫度範圍內進行；一般而言，其可於溫度約 -78°C 至約 200°C ，較佳為約 -10°C 至約 150°C 進行。該反應較佳為於常壓下，惟亦可於高壓或減壓下進行。反應時間為0.1至72小時，較佳為0.1至24小時。

製法(a)之反應亦可使用適當金屬觸媒例如過渡金屬觸媒如 $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ 、 $\text{Pd}_2(\text{dba})_3\text{CHCl}_3$ (dba=二亞苄基丙酮)、 $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ 、 CuI 、或 Cu_2O 進行。若需要，則可使用膦配位體例如2,2'-雙(二苯膦基)-1,1'-聯萘(BINAP)、4,5-雙(二苯

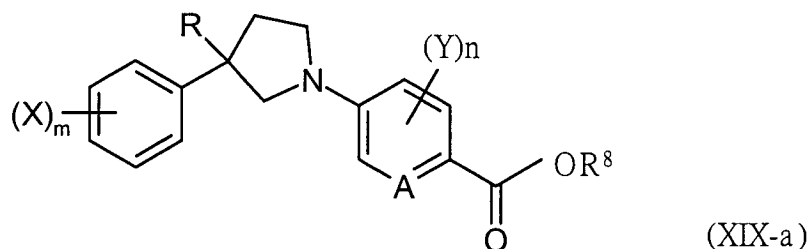
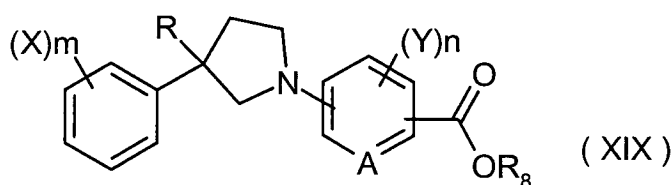
膦基)-9,9-二甲基吡(Xantphos)三丁基膦等或胺配位體例如 8-喹啉醇、脯胺酸、N,N-二甲基甘胺酸等進行。

進行製法(a)時，舉例而言，係使 1 莫耳式(II)化合物與 1 至 3 莫耳式(III)或式(III-a)化合物，於 1 至 3 莫耳鹼及 5 催化用量 $\text{Pd}_2(\text{dba})_3\text{CHCl}_3$ 與 Xantphos 存在下，在稀釋劑例如甲苯中進行，獲得本發明式(I)或式(Ia)各別化合物。

於製法(b)中使用之式(IV)或式(IV-a)化合物為新穎之化合物；彼等可利用下述方法合成。式(II)化合物可與下式(XVIII)所示化合物反應：



式中 Y、A、n 與 L^1 具有如本文界定之相同意義， R^8 代表氫或 C_{1-4} 烷基，獲得式(XIX)或式(XIX-a)所示化合物：



15 式中 X、Y、R、A、m、n 與 R^8 具有如本文界定之相同意義。當 R^8 代表 C_{1-4} 烷基時，則可使上述式(XIX)或式(XIX-a)化合物水解，獲得式(IV)或式(IV-a)化合物。

化合物式(XVIII)為已知化合物，包括，例如，下述化合物：4-碘苯甲酸甲酯；4-溴-2-甲基苯甲酸甲酯；2-氟-4-碘苯甲酸乙酯；2-氟-4-碘苯甲酸甲酯；2-溴-4-碘苯甲酸甲酯；4-氟-2-硝基苯甲酸甲酯；及4-氟-2-(三氟甲基)苯甲酸乙酯。

為製法(b)起始物質之式(V)或式(V-a)化合物乃悉知化合物。

舉例而言，式(IV)或式(IV-a)化合物可容易地利用與氯化劑例如亞硫醯氯、草醯氯或五氯化磷反應之方法；或與有機鹵化物例如三甲基乙醯氯反應之方法；或與羰基二咪唑或磺醯基咪唑反應之方法等獲得。

製法(b)中之式(IV)與式(IV-a)代表性化合物分別包括：4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苯甲酸；4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-硝基苯甲酸；4-{3-[3,5-雙(三氟甲基)苯基]-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基}-2-硝基苯甲酸；4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-(三氟甲基)苯甲酸等。

式(V)與式(V-a)代表性化合物分別包括：4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苯甲醯基氯；4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-硝基苯甲醯基氯；4-{3-[3,5-雙(三氟甲基)苯基]-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基}-2-硝基苯甲醯基氯等。

為製法(b)起始物質之化合物式(VI)乃悉知化合物。

代表性實例包括：甲胺；乙胺、環丙胺、炔丙胺、2,2,2-

三氟乙胺、2-吡啶基甲胺、3-胺甲基-6-氯吡啶等。

製法(b)之反應可使用下述縮合劑進行：1,3-二環己基
碳化二亞胺(DCC)、1-乙基-3-(3'-二甲胺基丙基)-碳化二亞
胺鹽酸鹽(WSCI)、羰基二咪唑(CDI)、氰基磷酸二乙酯
5 (DEPC)、2-氯-1-甲基吡啶鎰(Mukouyama 試劑)等。

進行製法(b)時，舉例而言，可使 1 莫耳式(IV)或式(IV-a)
化合物與 1 至 3 莫耳式(VI)化合物於稀釋劑(例如 DMF)中
反應，使用 1 莫耳至 3 莫耳縮合劑，需要時，使用催化用
量之添加劑例如 1-羥基苯并三唑，獲得對應之式(I)或式(Ia)
10 化合物。

為製法(c)起始物質之(Ib)或式(Ie)化合物，包含於以製
法(b)製得之本發明式(I)或式(Ia)中。

為起始物質之式(VII)化合物乃悉知化合物，其具體實
例包括碘甲烷、碘乙烷等。

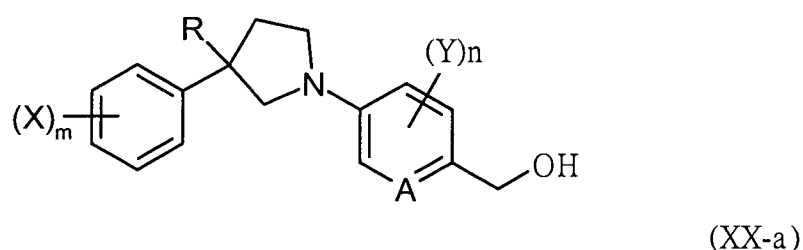
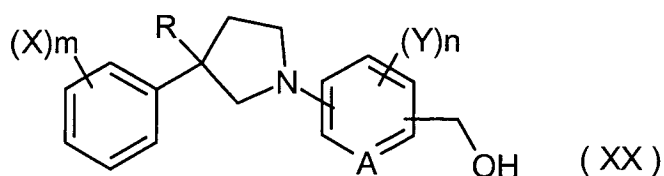
15 進行製法(c)時，舉例而言，可使 1 莫耳式(Ib)或式(Ie)
化合物與 1 至 5 莫耳式(VII)化合物於鹼存在下，在稀釋劑
(例如 THF)中反應，獲得對應之式(I)或式(Ia)化合物。

為製法(d)起始物質之(If)或式(Id)化合物，包含於以製
法(b)或(c)製得之本發明式(I)或式(Ia)中。

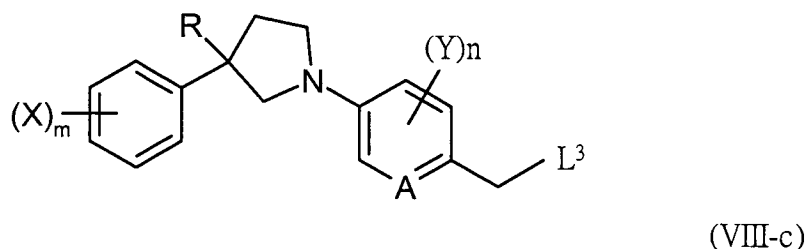
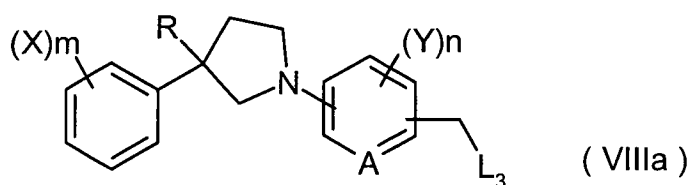
20 製法(d)中所用之硫化劑包括五硫化磷、拉威森試劑
等。

進行製法(d)時，舉例而言，可使 1 莫耳式(If)或式(Id)
化合物與 0.5 至 3 莫耳拉威森試劑於稀釋劑(例如甲苯)中
反應，獲得對應之式(I)或式(Ia)化合物。

為製法(e)起始物質之化合物式(VIII)或式(VIII-b)係新穎之化合物，可利用下述方法合成：使上述式(XIX)或式(XIX-a)化合物還原，以獲得式(XX)或式(XX-a)所示化合物：



式中 X、Y、R、A、m 與 n 具有如本文界定之相同意義，然後以習知方式進行例如鹵化或烷基磺醯化反應，獲得式(VIII-a)或(VIII-c)所示化合物：



式中 X、Y、R、A、m、n 與 L³ 具有如上述之相同界定。

製法(e)中式(VIII)與式(VIII-b)之代表性實例分別包括：1-[3-氯-4-(氯甲基)苯基]-3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲

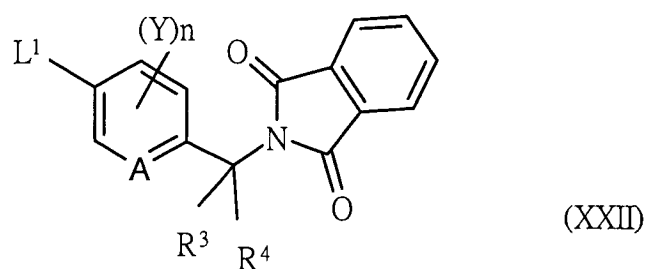
基)吡咯烷；4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苄基甲苯磺酸酯；1-[3-溴-4-(氯甲基)苯基]-3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷等。

為製法(e)起始物質之式(IX)化合物乃悉知化合物，其
5 代表性實例包括：乙醯胺；丙醯胺；苯甲醯胺；2-氯苯甲醯胺；3-氯苯甲醯胺；4-氯苯甲醯胺等。

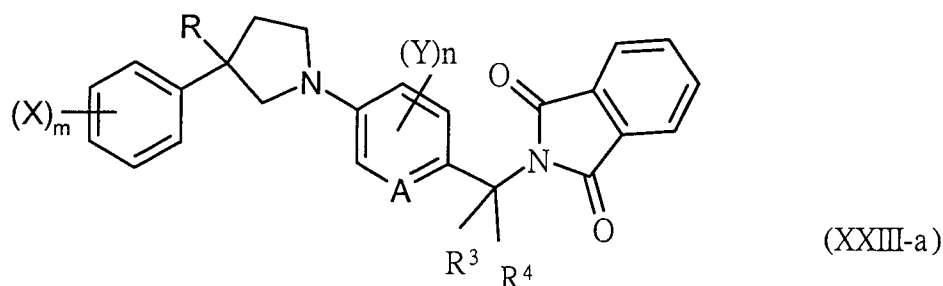
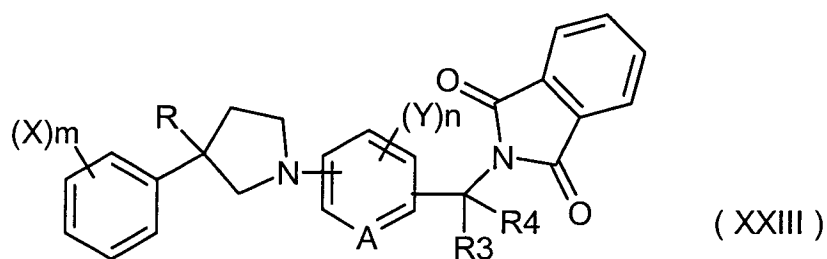
進行製法(e)時，舉例而言，可使 1 莫耳式(VIII)或式(VIII-b)與 1 至 3 莫耳式(IX)於鹼存在下，在稀釋劑(例如 THF)中反應，獲得對應之式(I)或式(Ia)化合物。

10 為製法(f)起始物質之式(X)、或式(X-a)化合物係新穎之化合物，可利用使式(VIII)或式(VIII-b)化合物與化合物 R^5-NH_2 (XXI)(式中 R_5 具有如本文界定之相同意義)反應製得。

15 化合物式(X)或式(X-a)中 1 為 1 之化合物亦可利用替代方法合成：該方法包括使上述式(II)化合物與下式所示化合物(XXII)反應：



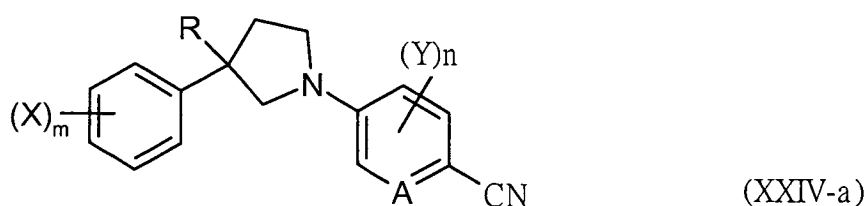
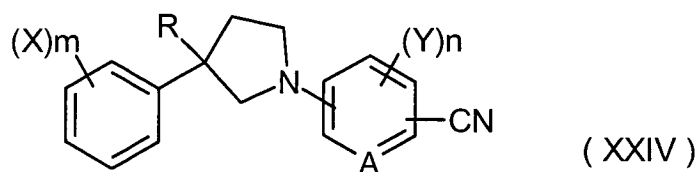
20 式中 Y、A、 R^3 、 R^4 、n 與 L^1 具有如本文界定之相同意義，獲得式(XXIII)或式(XXIII-a)所示化合物：



式中 X 、 Y 、 R 、 A 、 m 、 n 、 R^3 與 R^4 具有如本文界定之相同意義，然後根據 Gabriel 合成反應予以進行。

- 5 上述式(XXII)化合物為已知化合物，其包括：2-(4-溴苄基)-1H-異吲哚-1,3(2H)-二酮；2-(4-溴-2-硝基苄基)-1H-異吲哚-1,3(2H)-二酮；2-(4-碘苄基)-1H-異吲哚-1,3(2H)-二酮；2-(4-碘-2-硝基苄基)-1H-異吲哚-1,3(2H)-二酮；2-(2-氯-4-碘苄基)-1H-異吲哚-1,3(2H)-二酮。

- 10 式(X)或式(X-a)中 R^3 、 R^4 與 R^5 代表氫之化合物可容易地利用替代方法合成：該方法包括使式(XXIV)或式(XXIV-a)所示腈化合物進行一般還原反應：



式中 X、Y、R、m 與 n 具有如本文界定之相同意義。

上述式(XXIV)或式(XXIV-a)化合物係新穎化合物，可如下述合成實例 8 所示製得。

製法(f)中式(X)與式(X-a)之代表性實例分別包括：

- 5 1-{2-氯-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苯基}甲胺；1-{2-溴-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苯基}甲胺等。

為製法(f)起始物質之式(XI)化合物乃悉知化合物，其具體實例包括：乙醯氯；丙醯氯；苯甲醯氯；2-氯苯甲醯
10 氯；3-氯苯甲醯氯；4-氯苯甲醯氯；菸鹼醯氯鹽酸鹽等。

進行製法(f)時，舉例而言，可使 1 莫耳式(X)或式(X-a)化合物與 1 至 3 莫耳式(XI)於鹼存在下，在稀釋劑(例如 THF)中反應，獲得對應之式(I)或式(Ia)化合物。

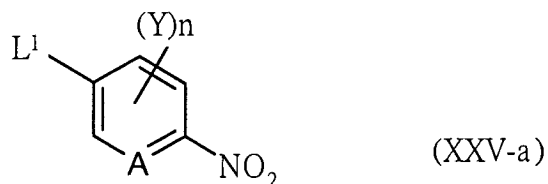
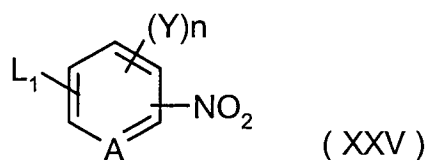
為製法(g)起始物質之(Ic)或式(Ig)化合物，包含於以上
15 述製法(e)或(f)製得之本發明式(I)或式(Ia)中。

為起始物質之式(XII)化合物乃悉知化合物，其具體實例包括碘甲烷、碘乙烷、乙醯氯等。

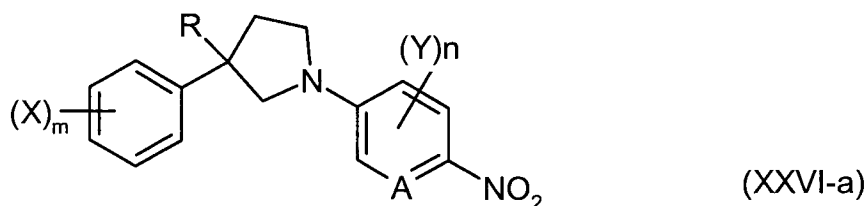
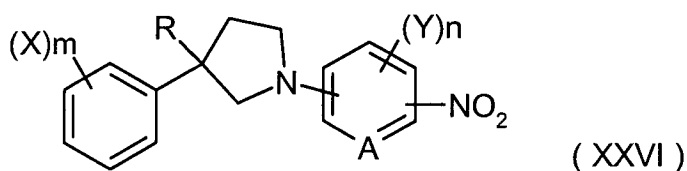
進行製法(g)時，舉例而言，可使 1 莫耳式(Ic)或式(Ig)化合物與 1 至 3 莫耳式(XII)於鹼存在下，在稀釋劑(例如
20 THF)中反應，獲得對應之式(I)或式(Ia)化合物。

為製法(h)起始物質之式(XIII)或式(XIII-a)化合物係新穎之化合物，可利用下述方法合成。

詳言之，使上述式(II)化合物與下式所示化合物(XXV)或式(XXV-a)反應：



式中 Y、A、n 與 L^1 具有如本文界定之相同意義，獲得式 (XXVI) 或式 (XXVI-a) 所示化合物：



式中 X、Y、R、A、m 與 n 具有如本文界定之相同意義，然後使其還原，獲得式 (XIII) 或式 (XIII-a) 化合物。

式 (XXV) 與式 (XXV-a) 之具體實例化合物包括：2-氟-4-硝基苯；2-溴-4-硝基苯；2-碘-4-硝基苯；2-溴-4-氟硝基苯；4-氟-2-甲基硝基苯等。

特別是，於製法 (h) 中，式 (XIII) 與式 (XIII-a) 之代表性實例包括：4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苯胺；2-溴-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苯胺等。

為製法 (h) 起始物質之二烷氧四氫呋喃係已知化合

物，其具體實例包括：2,5-二甲氧四氫呋喃；2,5 二乙氧四氫呋喃等。

進行製法(h)時，舉例而言，可使 1 莫耳式(XIII)或式(XIII-a)化合物與 1 至 5 莫耳 2,5-二甲氧四氫呋喃於稀釋劑(例如乙酸)中反應，獲得對應之本發明式(I)或式(Ia)化合物。

為製法(h)起始物質之式(XIII)或式(XIII-a)化合物係新穎之化合物，可利用下述方法合成。

製法(h)中，該反應，於使用 1,2-二甲醯肼時，可於鹼及三烷基鹵矽烷存在下進行。

鹼之實例可包括有機鹼例如三乙胺、二異丙基乙胺、三丁胺、N-甲基嗎啉、N,N-二甲基苯胺、N,N-二乙基苯胺、4-第三丁基-N,N-二甲基苯胺、吡啶、甲基吡啶、二甲基吡啶、二吡雙環十一烯、二吡雙環辛烷、咪唑等。

三烷基鹵矽烷之代表性實例包括：三甲基氯矽烷；三乙基氯矽烷；三甲基溴矽烷等。

進行製法(h)時，舉例而言，可使 1 莫耳式(XIII)或式(XIII-a)化合物與 1 至 5 莫耳 1,2-二甲醯肼、1 至 10 莫耳鹼及 1 至 25 莫耳三烷基鹵矽烷，於大為超量之吡啶中反應，獲得所需之對應式(I)或式(Ia)化合物。

製法(h)中，於疊氮化鈉與三烷基原甲酸酯反應之情形下，三烷基原甲酸酯之實例可包括原甲酸三甲酯與原甲酸三乙酯等。

進行製法(h)時，舉例而言，可使 1 莫耳式(XIII)或式

(XIII-a)化合物與 1 至 3 莫耳疊氮化鈉及 1 至 10 莫耳三烷基原甲酸酯於稀釋劑(例如乙酸)中反應，獲得對應之本發明式(I)或式(Ia)化合物。

5 為製法(i)起始物質之式(XIV)或式(XIV-a)化合物係新穎之化合物，可利用下述方法合成。詳言之，使上述式(XIII)或式(XIII-a)化合物進行有機化學領域中已知之山德邁爾(Sandmeyer's)反應，隨後予以還原，獲得式(XIV)或式(XIV-a)化合物。

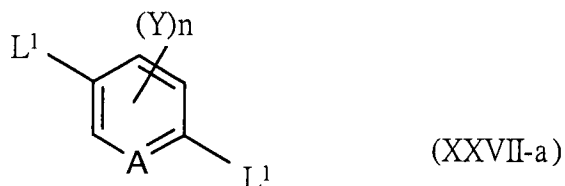
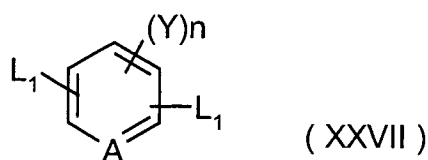
式(XIV)與式(XIV-a)之代表性實例分別可包括：

10 3-(3,5-二氯苯基)-1-(4-胼苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷；
3-(3,5-二氯苯基)-1-(4-胼基-3-甲基苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷等。

作為製法(i)起始物質用之 2,5-二烷氧四氫呋喃類係已知化合物，其代表性實例包括：1,1,3,3-四甲氧丙烷；1,1,3,3-
15 四乙氧丙烷等。

進行製法(i)時，舉例而言，可使 1 莫耳式(XIV)或式(XIV-a)化合物與 1 至 5 莫耳 1,1,3,3-四烷氧丙烷及，需要時，添加催化用量之酸例如硫酸，於稀釋劑(例如乙醇)中反應，獲得對應之本發明式(I)或式(Ia)化合物。

20 為製法(j)起始物質之式(XV)或式(XV-a)化合物係新穎化合物，可利用下述方法合成。詳言之，使上述式(II)化合物與下式(XXVII)或式(XXVII-a)所示化合物反應



式中 Y、A、n 與 L^1 具有如本文界定之相同意義，獲得式 (XV) 或式 (XV-a) 化合物。

上述式 (XXVII) 與式 (XXVII-a) 化合物之具體實例分別包括：2-氟-5-碘苯甲腈；5-溴-2-氟苯甲腈；1-氯-4-碘-2-硝基苯；1,4-二溴苯；1,4-二碘苯等。

製法 (j) 中，式 (XV) 與式 (XV-a) 之代表性實例可包括：5-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-氟苯甲腈；5-{3-[3,5-雙(三氟甲基)苯基]-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基}-2-氟苯甲腈等。

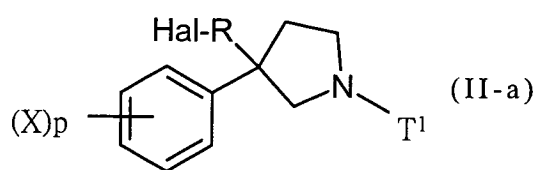
為製法 (j) 起始物質之許多式 G2-H、G3-H、G4-H、G5-G、G6-H、G8-H、G9-H 所示化合物係已知化合物，其具體實例可包括：1H-咪唑；1H-吡唑；4-甲基-1H-吡唑；4-氟-1H-吡唑；4-氯-1H-吡唑；4-溴-1H-吡唑；4-碘-1H-吡唑；4-硝基-1H-吡唑；4-甲基-1H-吡唑；3-三氟甲基-1H-吡唑；4-三氟甲基-1H-吡唑；4-氰基-1H-吡唑；1H-1,2,3-三唑；1H-1,2,4-三唑；1H-四唑；5-甲基-1H-四唑；5-(甲基硫基)-1H-四唑等。

進行製法 (j) 時，舉例而言，可使 1 莫耳式 (XV) 或式

(XV-a)化合物與 1 至 3 莫耳 G6-H 於 1 至 3 莫耳鹼存在下，在稀釋劑(例如 DMF)中反應，獲得對應之本發明式(I)或式(Ia)化合物。

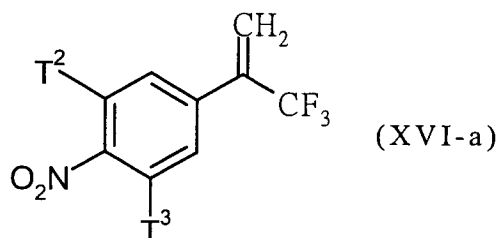
於本發明式(I)或式(Ia)化合物之諸製法中，原料(起始物質與中間產物)化合物中之新穎物質可共同以下述諸式表示：

式(II-a)



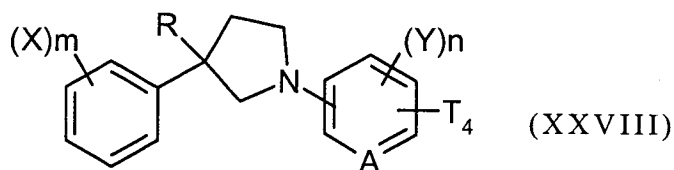
式中 X 具有如本文界定之相同意義， T^1 代表氫或苄基、 Hal-R 代表鹵烷基、及 p 代表 1、2、3, 4 或 5；

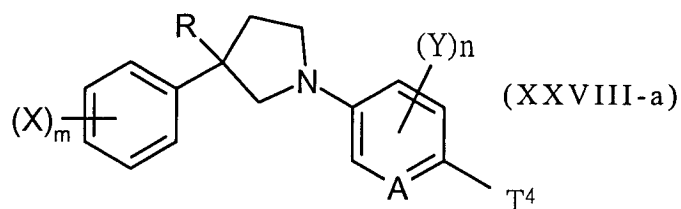
式(XVI-a)



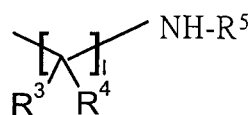
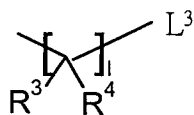
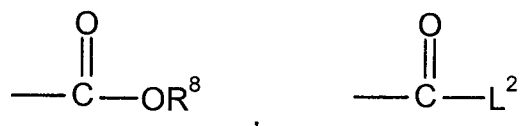
式中 T^2 與 T^3 各自獨立地代表烷基；

式(XXVIII)化合物或式(XXVIII-a)化合物





式中 X、Y、R、A、m 與 n 具有如上文之相同界定， T^4 代表：



氰基、胺基或硝基， R^8 、 L^2 、 L^3 、 R^3 、 R^4 與 R^5 具有如本文界定之相同意義。

根據本發明之化合物具有強力之殺昆蟲及殺蟎活性。

因此，本發明式(I)或式(Ia)所示化合物可作為殺昆蟲劑及/或殺蟎劑用；彼等特別適用於農業領域。根據本發明之化合物對有害昆蟲亦發揮適當防治效力且對栽培植物無植物毒性。此外，本發明化合物可用於防治廣寬種類之害物包括，例如，有害之吸吮昆蟲、叮咬昆蟲及其他植物寄生性害物、貯糧害物與保健害物以及獸醫領域之害物及可施用於其防治，特別是消滅及根除。因此，本發明亦涵蓋用於對抗有害害物之方法。

該等害物昆蟲包括例如

甲蟲類，例如綠豆象(*Callosobruchus Chinensis*)、玉
米象(*Sitophilus zeamais*)、赤擬穀盜(*Tribolium*
Castaneum)、大二十八星瓢蟲(*Epilachna*
5 *vigintioctomaculata*)、大麥細胸叩甲(*Agriotes fuscicollis*)、
大豆姬金龜(*Anomala rufocuprea*)、科羅拉多馬鈴薯甲蟲
(*Leptinotarsa decemlineata*)、葉甲(*Diabrotica*)屬、日本松
斑天牛(*Monochamus alternatus*)、稻象甲(*Lissorhoptrus*
oryzophilus)、歐洲竹粉蠹(*Lyctus bruneus*)、黃守瓜
10 (*Aulacophora femoralis*)；

鱗翅類害物，例如舞毒蛾(*Lymantria dispar*)、天幕毛
蟲(*Malacosoma neustria*)、菜粉蝶(*Pieris rapae*)、斜紋夜蛾
(*Spodoptera litura*)、甘藍夜蛾(*Mamestra brassicae*)、二化
螟蟲(*Chilo suppressalis*)、鐘麻粟螟(*Pyrausta nubilalis*)、
15 粉斑螟蛾(*Ephestia cautella*)、茶姬捲葉蛾(*Adoxophyes*
orana)、蘋果蠹蛾(*Carpocapsa pomonella*)、普通夜蛾
(*Agrotis fucosa*)、大蠟蛾(*Galleria mellonella*)、小菜蛾
(*Plutella maculipennis*)、美洲煙夜蛾(*Heliothis virescens*)、
柑桔潛葉蛾(*Phyllocnistis citrella*)；

20 半翅類害物，例如黑尾葉蟬(*Nephotettix cincticeps*)、
稻褐飛虱(*Nilaparvata lugens*)、康氏粉蚧(*Pseudococcus*
comstocki)、矢尖蚧(*Unaspis yanonensis*)、桃蚜(*Myzus*
persicas)、蘋果蚜(*Aphis pomi*)、棉蚜(*Aphis gossypii*)、菜
縊管蚜(*Rhopalosiphum pseudobrassicas*)、梨花網蝽

(*Stephanitis nashi*)、*Nazara* 屬、溫室白粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、木虱(*Psylla*)屬；

薊馬類害物，例如南黃薊馬(*Thrips palmi*)、苜蓿薊馬(*Frankliniella occidentalis*)；

- 5 直翅類害物，例如德國小蠊(*Blattella germanica*)、美洲大蠊(*Periplaneta americana*)、非洲螻蛄(*Gryllotalpa africana*)、東亞飛蝗(*Locusta migratoria migratoria*)；

等翅目(*Isoptera*)害物，例如黃胸散白蟻(*Reticulitermes speratus*)、台灣家白蟻(*Coptotermes formosanus*)；

- 10 雙翅類害物，例如家蠅(*Musca domestica*)、黃熱病蚊蟲埃及伊蚊(*Aedes aegypti*)、菜豆種蠅(*Hylemia platura*)、尖音庫蚊(*Culex pipiens*)、中華瘧蚊(*Anopheles sinensis*)、三帶喙庫蚊(*Culex tritaeniorhynchus*)、非洲菊斑潛蠅(*Liriomyza trifolii*)；

- 15 蟎類，例如朱砂葉蟎(*Tetranychus cinnabarinus*)、二斑葉蟎(*Tetranychus urticae*)、柑桔全爪蟎(*Panonychus citri*)、桔刺皮癭蟎(*Aculops pelekassi*)、跗線蟎(*Tarsonemus*)屬；

- 20 線蟲類害物，例如甘藷根瘤線蟲(*Meloidogyne incognita*)、松材線蟲(*Bursaphelenchus lignicolus* Mamiya et Kiyohara)、水稻白尖病葉芽線蟲(*Aphelenchoides besseyi*)、大豆包囊線蟲(*Heterodera glycines*)、根腐線蟲(*Pratylenchus*)屬。

此外，結合良好植物耐受性、對溫血動物之有利毒性

及與環境之高相容性之根據本發明之活性化合物適用於保護作物及作物器官，以增加收穫產量、增進收穫物品質及防治動物害物(詳言之，為農業、園藝、動物飼養上，森林、庭園與休閒設施中與保護貯存產品及物料相關，及於保健
5 領域中之昆蟲、蛛形綱動物、蛔蟲、線蟲與軟體動物)。根據本發明之活性化合物較佳為作為作物保護劑用；彼等對於一般敏感與抗性品系及所有或若干發育階段均具活性。藉使用根據本發明之化合物與組成物可對抗之害物進一步包括：

10 屬於蟲目(Anoplura)(Phthiraptera)者，例如，羊蟲(*Dalmalinia*)屬、血蟲(*Haematopinus*)屬、毛蟲(*Linognathus*)屬、體蟲(*Pediculus*)屬、啣毛蟲(*Trichodectes*)屬；

屬於蛛形綱(Arachnida)者，例如，粗腳粉蟎(*Acarus siro*)、桔芽癭蟎(*Aceria sheldoni*)、刺皮癭蟎(*Aculops*)屬、
15 癭蟎(*Aculus*)屬、花蜱(*Amblyomma*)屬、隱喙蜱(*Argas*)屬、牛蜱(*Boophilus*)屬、偽葉蟎(*Brevipalpus*)屬、苜蓿苔蟎(*Bryobia praetiosa*)、食皮蚧蟲(*Chorioptes*)屬、雞皮刺蟎(*Dermanyssus gallinae*)、始葉蟎(*Eotetranychus*)屬、梨葉銹蟎(*Epitrimerus pyri*)、葉蟎(*Eutetranychus*)屬、癭蟎
20 (*Eriophyes*)屬、半跗線蟎(*Hemitarsonemus*)屬、璃眼蜱(*Hyalomma*)屬、硬蜱(*Ixodes*)屬、黑寡婦球腹蛛(*Latrodectus mactans*)、葉蟎(*Metatetranychus*)屬、葉蟎(*Oligonychus*)屬、鈍喙蜱(*Ornithodoros*)屬、全爪蟎(*Panonychus*)屬、柑橘銹蟎(*Phyllocoptruta oleivora*)、茶細蟎

(*Polyphagotarsonemus latus*)、癢蟎(*Psoroptes*)屬、扇頭蜱(*Rhipicephalus*)屬、根蟎(*Rhizoglyphus*)屬、疥蟎(*Sarcoptes*)屬、中東金蠍(*Scorpio maurus*)、細蟎(*Stenotarsonemus*)屬、跗線蟎屬、葉蟎(*Tetranychus*)屬、瘤癭蟎屬之 *Vasates lycopersici* ;

屬於雙殼綱(*Bivalva*)者，例如，斑紋蚌(*Dreissena*)屬；

屬於唇足目(*Chilopoda*)者，例如，地蜈蚣(*Geophilus*)屬、蚰蜒(*Scutigera*)屬；

屬於鞘翅目(*Coleoptera*)者，例如，大豆象

10 (*Acanthoscelides obtectus*)、麗金龜(*Adoretus*)屬、*Agelastica alni*、叩甲(*Agriotes*)屬、六月金龜(*Amphimallon solstitialis*)、家具竊蠹(*Anobium punctatum*)、天牛(*Anoplophora*)屬、象甲(*Anthonomus*)屬、皮蠹(*Anthrenus*)屬、甘蔗金龜(*Apogonia*)屬、寶螺(*Atomaria*)屬、黑皮蠹
15 (*Attagenus*)屬、豆象屬之 *Bruchidius obtectus*、豆象(*Bruchus*)屬、象甲(*Ceuthorhynchus*)屬、象鼻蟲屬之 *Cleonus mendicus*、金針蟲(*Conoderus*)屬、象鼻蟲(*Cosmopolites*)屬、草蛆(*Costelytra zealandica*)、象蟲(*Curculio*)屬、隱喙象屬之 *Cryptorhynchus lapathi*、皮蠹(*Dermestes*)屬、葉甲
20 屬、瓢蟲(*Epilachna*)屬、古巴象鼻蟲(*Faustinus cubae*)、麥珠甲(*Gibbium psylloides*)、*Heteronychus arator*、*Hylamorpha elegans*、家天牛(*Hylotrupes bajulus*)、苜蓿葉象甲(*Hypera postica*)、小蠹(*Hypothenemus*)屬、黑金龜屬之 *Lachnosterna consanguinea*、馬鈴薯甲蟲、稻象甲、象

甲 (*Lixus*) 屬、粉蠹 (*Lyctus*) 屬、花粉甲蟲 (*Meligethes aeneus*)、鰓角金龜 (*Melolontha melolontha*)、*Migdolus* 屬、天牛 (*Monochamus*) 屬、象鼻蟲屬之 *Naupactus xanthographus*、金黃珠甲 (*Niptus hololeucus*)、犀角金龜

5 (*Oryctes rhinoceros*) 屬、鋸穀盜 (*Oryzaephilus surinamensis*)、深溝象甲 (*Otiorrhynchus sulcatus*)、小青花金龜 (*Oxycetonia jucunda*)、芥菜猿葉甲蟲 (*Phaedon cochleariae*)、鰓角金龜 (*Phyllophaga*) 屬、日本豆金龜 (*Popillia japonica*)、安第斯馬鈴薯象 (*Premnotrypes*) 屬、油

10 菜蘭跳甲 (*Psylliodes chrysocephala*)、蝟甲 (*Ptinus*) 屬、黑根瓢蟲 (*Rhizobius ventralis*)、穀蠹 (*Rhizopertha dominica*)、象鼻蟲 (*Sitophilus*) 屬、穀象 (*Sphenophorus*) 屬、象甲 (*Sternechus*) 屬、*Symphyletes* 屬、黃粉甲 (*Tenebrio molitor*)、粉甲 (*Tribolium*) 屬、斑皮蠹 (*Trogoderma*) 屬、象

15 甲 (*Tychius*) 屬、天牛 (*Xylotrechus*) 屬、步甲 (*Zabrus*) 屬；以及綠豆象、玉米象、赤擬穀盜、大二十八星瓢蟲、細胸叩甲、姬金龜、馬鈴薯甲蟲、葉甲屬、松斑天牛、稻水象甲、歐洲竹粉蠹、與黃守瓜；

屬於彈尾目 (*Collembola*) 者，例如，棘跳蟲屬之

20 *Onychiurus armatus*；

屬於革翅目 (*Dermaptera*) 者，例如，歐洲球蝽 (*Forficula auricularia*)；

屬於雙足目 (*Diplopoda*) 者，例如，*Blaniulus guttulatus*；

屬於雙翅目 (*Diptera*) 者，例如，伊蚊 (*Aedes*) 屬、按蚊

(*Anopheles*)屬、毛蚊屬之 *Bibio hortulanus*、紅頭麗蠅 (*Calliphora erythrocephala*)、地中海實蠅 (*Ceratitis capitata*)、麗蠅 (*Chrysomyia*)屬、旋蠅 (*Cochliomyia*)屬、盾波蠅 (*Cordylobia anthropophaga*)、庫蚊 (*Culex*)屬、疽蠅 5 (*Cuterebra*)屬、油橄欖實蠅 (*Dacus oleae*)、人膚蠅 (*Dermatobia hominis*)、果蠅 (*Drosophila*)屬、廐蠅 (*Fannia*)屬、胃蠅 (*Gastrophilus*)屬、種蠅 (*Hylemyia*)屬、*Hyppobosca*屬、皮蠅 (*Hypoderma*)屬、潛蠅 (*Liriomyza*)屬、綠蠅 (*Lucilia*)屬、家蠅 (*Musca*)屬、綠蟪 (*Nezara*)屬、狂蠅 (*Oestrus*)屬、 10 瑞典麥杵蠅 (*Oscinella frit*)、甜菜潛葉蠅 (*Pegomyia hyoscyami*)、蠅 (*Phorbia*)屬、螫蠅 (*Stomoxys*)屬、牛虻 (*Tabanus*)屬、夜蟬 (*Tannia*)屬、歐洲大蚊 (*Tipula paludosa*)、污蠅 (*Wohlfahrtia*)屬；以及家蠅、埃及伊蚊、菜豆種蠅、尖音庫蚊、中華瘧蚊、三帶喙庫蚊與非洲菊斑潛蠅；

15 屬於腹足綱 (*Gastropoda*)者，例如，蛞蝓 (*Arion*)屬、紅扁蝨 (*Biomphalaria*)屬、浦螺 (*Bulinus*)屬、野蛞蝓 (*Deroceras*)屬、*Galba* 屬、椎實螺 (*Lymnaea*)屬、釘螺 (*Oncomelania*)屬、椎實蝸牛 (*Succinea*)屬；

20 屬於蠕蟲綱 (*helminths*)者，例如，十二指腸鉤蟲 (*Ancylostoma duodenale*)、錫蘭鉤蟲 (*Ancylostoma ceylanicum*)、巴西鉤蟲 (*Ancylostoma braziliensis*)、鉤蟲 (*Ancylostoma*)屬、蛔蟲 (*Ascaris lubricoides*)、蛔蟲 (*Ascaris*)屬、馬來絲蟲 (*Brugia malayi*)、帝汶絲蟲 (*Brugia timori*)、反芻獸鉤蟲 (*Bunostomum*)屬、夏柏線蟲 (*Chabertia*)屬、分

枝睪吸蟲 (*Clonorchis*) 屬、豆娘 (*Cooperia*) 屬、吸蟲 (*Dicrocoelium*) 屬、絲狀肺蟲 (*Dictyocaulus filaria*)、廣頭裂節條蟲 (*Diphyllbothrium latum*)、麥地那龍線蟲 (*Dracunculus medinensis*)、顆粒性包生條蟲 (*Echinococcus* 5 *granulosus*)、多房性包生條蟲 (*Echinococcus multilocularis*)、蟯蟲 (*Enterobius vermicularis*)、吸蟲 (*Faciola*) 屬、血線蟲 (*Haemonchus*) 屬、盲腸蟲 (*Heterakis*) 屬、短小包膜條蟲 (*Hymenolepis nana*)、圓蟲 (*Hyostrogylus*) 屬、羅阿血絲蟲 (*Loa loa*)、細頸線蟲 (*Nematodirus*) 屬、腸 10 結節蟲 (*Oesophagostomum*) 屬、肝吸蟲 (*Opisthorchis*) 屬、蟠尾絲蟲 (*Onchocerca volvulus*)、胃蟲 (*Ostertagia*) 屬、肺吸蟲 (*Paragonimus*) 屬、血吸蟲 (*Schistosoma*) 屬、福氏糞圓線蟲 (*Strongyloides fuelleborni*)、糞小桿線蟲 (*Strongyloides stercoralis*)、桿狀線蟲 (*Strongyloides*) 屬、無鉤條蟲 (*Taenia* 15 *saginata*)、有鉤條蟲 (*Taenia solium*)、旋毛蟲 (*Trichinella spiralis*)、豬旋毛蟲 (*Trichinella nativa*)、旋毛蟲屬之 *Trichinella britovi*、旋毛蟲屬之 *Trichinella nelsoni*、旋毛蟲屬之 *Trichinella pseudospiralis*、*Trichostrongylus* 屬、人鞭蟲 (*Trichuris trichuria*)、班氏絲蟲 (*Wuchereria bancrofti*);

20 再者可防治原生動物，例如艾美 (*Eimeria*) 屬球蟲；

屬於異翅亞目 (*Heteroptera*) 者，例如，南瓜緣蝽 (*Anasa tristis*)、*Antestiopsis* 屬、長蝽 (*Blissus*) 屬、*Calocoris* 屬、*Campylomma livida*、蝽象 (*Cavelerius*) 屬、臭蟲 (*Cimex*) 屬、盲蝽屬之 *Creontiades dilutus*、*Dasynus piperis*、*Dichelops*

furcatus、*Diconocoris hewetti*、紅椿(*Dysdercus*)屬、褐椿(*Euschistus*)屬、褐盾椿(*Eurygaster*)屬、*Heliopeltis* 屬、*Horcias nobilellus*、緣椿象(*Leptocorisa*)屬、葉足緣椿(*Leptoglossus phyllopus*)、盲椿(*Lygus*)屬、*Macropes excavatus*、盲椿科(*Miridae*)、椿象(*Nezara*)屬、稻盾椿(*Oebalus*)屬、*Pentomidae*、甜菜擬網椿(*Piesma quadrata*)、*Piezodorus* 屬、棉跳盲椿(*Psallus seriatus*)、*Pseudacysta perseae*、錐鼻蟲(*Rhodnius*)屬、可可褐盲(*Sahlbergella singularis*)、稻椿(*Scotinophora*)屬、梨花網椿、*Tibraca* 屬、
 10 獵椿(*Triatoma*)屬；

屬於同翅目(Homoptera)者，例如，無網長管蚜(*Acyrtosipon*)屬、*Aeneolamia* 屬、*Agonoscena* 屬、粉虱(*Aleurodes*)屬、甘蔗粉虱(*Aleurolobus barodensis*)、粉虱(*Aleurothrixus*)屬、葉蟬(*Amrasca*)屬、李薊圓尾蚜
 15 (*Anuraphis cardui*)、圓蚧(*Aonidiella*)屬、梨瘤蚜(*Aphanostigma piri*)、蚜(*Aphis*)屬、葡萄浮塵子(*Arboridia apicalis*)屬、圓蚧(*Aspidiella*)屬、圓蚧(*Aspidiotus*)屬、*Atanus* 屬、馬鈴薯長鬚蚜(*Aulacorthum solani*)、粉虱(*Bemisia*)屬、桃李短尾蚜(*Brachycaudus helichrysi*)、微管
 20 蚜(*Brachycolus*)屬、甘藍蚜(*Brevicoryne brassicae*)、*Calligypona marginata*、葉蟬屬之 *Carneocephala fulgida*、甘蔗棉蚜(*Ceratovacuna lanigera*)、沫蟬科(*Cercopidae*)、蠟蚧(*Ceroplastes*)屬、草莓毛管蚜(*Chaetosiphon fragaefolii*)、蔗黃雪盾蚧(*Chionaspis tegalensis*)、葉蟬屬

之 *Chlorita onukii*、胡桃黑斑蚜 (*Chromaphis juglandicola*)、茶褐圓蚧 (*Chrysomphalus ficus*)、*Cicadulina mbila*、*Coccoomytilus halli*、蚧 (*Coccus*) 屬、茶蔗隱瘤額蚜 (*Cryptomyzus ribis*)、*Dalbulus* 屬、粉蝨 (*Dialeurodes*) 屬、
 5 木蝨 (*Diaphorina*) 屬、介殼蟲 (*Diaspis*) 屬、*Doralis* 屬、草履蚧 (*Drosicha*) 屬、蚜蟲 (*Dysaphis*) 屬、粉蚧 (*Dysmicoccus*) 屬、葉蟬 (*Empoasca*) 屬、棉蚜 (*Eriosoma*) 屬、斑葉蟬 (*Erythroneura*) 屬、二葉葉蟬 (*Euscelis bilobatus*)、咖啡根
 蚧 (*Geococcus coffeae*)、琉璃葉蟬 (*Homalodisca*
 10 *coagulata*)、桃大尾蚜 (*Hyalopterus arundinis*)、介殼蟲 (*Icerya*) 屬、褐葉蟬 (*Idiocerus*) 屬、葉蟬 (*Idioscopus*) 屬、稻灰飛虱 (*Laodelphax striatellus*)、蠟蚧 (*Lecanium*) 屬、蠣蚧 (*Lepidosaphes*) 屬、菜縊管蚜 (*Lipaphis erysimi*)、長管蚜 (*Macrosiphum*) 屬、*Mahanarva fimbriolata*、高粱黍蚜
 15 (*Melanaphis sacchari*)、*Metcalfiella* 屬、薔薇麥蚜 (*Metopolophium dirhodum*)、黑緣平翅斑蚜 (*Monellia costalis*)、*Monelliopsis pecanis*、瘤額蚜 (*Myzus*) 屬、萵苣蚜蟲 (*Nasonovia ribisnigri*)、葉蟬 (*Nephotettix*) 屬、稻褐飛虱、*Oncometopia* 屬、旌蚧屬之 *Orthezia praelonga*、檉柳
 20 粉虱 (*Parabemisia myricae*)、木虱 (*Paratrioza*) 屬、蚧 (*Parlatoria*) 屬、癭棉蚜 (*Pemphigus*) 屬、玉米飛蝨 (*Peregrinus maidis*)、粉蚧 (*Phenacoccus*) 屬、*Phloeomyzus passerinii*、*Phorodon humuli*、根瘤蚜 (*Phylloxera*) 屬、黃介殼蟲 (*Pinnaspis aspidistrae*)、粉蚧 (*Planococcus*) 屬、梨形

原綿蚧(*Protopulvinaria pyriformis*)、桑蚧(*Pseudaulacaspis pentagona*)、粉蚧(*Pseudococcus*)屬、木虱(*Psylla*)屬、金小蜂(*Pteromalus*)屬、蠟蟬(*Pyrilla*)屬、圓蚧(*Quadraspidiotus*)屬、*Quesada gigas*、瓢蟲(*Rastrococcus*)屬、縊管蚜
 5 (*Rhopalosiphum*)屬、硬蚧(*Saissetia*)屬、葉蟬屬之
Scaphoides titanus、麥二叉蚜(*Schizaphis graminum*)、刺盾
 蚧(*Selenaspidus articulatus*)、飛虱(*Sogatata*)屬、白背飛虱
 (*Sogatella furcifera*)、飛虱(*Sogatodes*)屬、沫蟬屬之
Stictocephals festina、*Tenalaphara malayensis*、核桃黑蚜
 10 (*Tinocallis caryaefoliae*)、沫蟬(*Tomaspis*)屬、二叉蚜
 (*Toxoptera*)屬、溫室粉虱(*Trialeurodes vaporariorum*)、木
 蝨(*Trioza*)屬、葉蟬(*Typhlocyba*)屬、盾蚧(*Unaspis*)屬、葡
 萄根瘤蚜(*Viteus vitifolii*)；

屬於膜翅目(Hymenoptera)者，例如，鋸角葉蜂(*Diprion*)
 15 屬、葉蜂(*Hoplocampa*)屬、蟻(*Lasius*)屬、廚蟻(*Monomorium pharaonis*)、胡蜂(*Vespa*)屬；

屬於等足目(Isopoda)者，例如，鼠婦(*Armadillidium vulgare*)、海蛆屬之 *Oniscus asellus*、*Porcellio scaber*；

屬於等翅目者，例如，網白蟻(*Reticulitermes*)屬、土
 20 白蟻(*Odontotermes*)屬；以及黃胸散白蟻與台灣家白蟻；

屬於鱗翅目(Lepidoptera)者，例如，桑劍紋夜蛾
 (*Acronicta major*)、白斑煩夜蛾(*Aedia leucomelas*)、地老虎
 (*Agrotis*)屬、*Alabama argillacea*、夜蛾(*Anticarsia*)屬、
Barathra brassicae、棉葉穿孔潛蛾(*Bucculatrix*

thurberiella)、松尺蠖 (*Bupalus piniarius*)、捲葉蛾屬之
Cacoecia podana、*Capua reticulana*、蘋果蠹蛾、*Cheimatobia*
brumata、螟 (*Chilo*) 屬、雲杉捲夜蛾 (*Choristoneura*
fumiferana)、葡萄果蠹蛾 (*Clysia ambiguella*)、捲螟
5 (*Cnaphalocerus*) 屬、埃及金剛鑽 (*Earias insulana*)、地中海
粉斑螟 (*Ephestia kuehniella*)、褐尾蛾 (*Euproctis*
chrysorrhoea)、切根蟲 (*Euxoa*) 屬、夜蛾 (*Feltia*) 屬、大蠟螟、
夜蛾 (*Helicoverpa*) 屬、夜蛾 (*Heliothis*) 屬、褐織葉蛾
(*Hofmannophila pseudospretella*)、茶捲夜蛾 (*Homona*
10 *magnanima*)、櫻桃巢蛾 (*Hyponomeuta padella*)、夜蛾
(*Laphygma*) 屬、細蛾屬之 *Lithocolletis blancardella*、綠果
夜蛾 (*Lithophane antennata*)、豆白緣切根蟲 (*Loxagrotis*
albicosta)、毒蛾 (*Lymantria*) 屬、天幕毛蟲、甘藍夜蛾、*Mocis*
repanda、東方黏蟲 (*Mythimna separata*)、*Oria* 屬、稻負泥
15 蟲 (*Oulema oryzae*)、*Panolis flammea*、紅鈴蟲 (*Pectinophora*
gossypiella)、柑桔潛夜蛾、粉蝶 (*Pieris*) 屬、小菜蛾 (*Plutella*
xylostella)、夜蛾 (*Prodenia*) 屬、一星黏蟲 (*Pseudaletia*) 屬、
大豆夜蛾 (*Pseudoplusia includens*)、鐘麻粟螟、黏蟲
(*Spodoptera*) 屬、*Thermesia gemmatilis*、網衣蛾 (*Tinea*
20 *pellionella*)、袋衣蛾 (*Tineola bisselliella*)、櫟綠捲葉蛾
(*Tortrix viridana*)、粉夜蛾 (*Trichoplusia*) 屬；以及舞毒蛾、
天幕毛蟲、菜粉蝶、斜紋夜蛾、甘藍夜蛾、二化螟蟲、鐘
麻粟螟、粉斑螟蛾、茶姬捲葉蛾、蘋果蠹蛾、普通夜蛾、
大蠟蛾、小菜蛾、美洲煙夜蛾與柑桔潛葉蛾；

屬於直翅目(Orthoptera)者，例如，家蟋蟀(*Acheta domesticus*)、東方蜚蠊(*Blatta orientalis*)、螻蛄(*Gryllotalpa*)屬、馬得拉蜚蠊(*Leucophaea maderae*)、飛蝗(*Locusta*)屬、蚱蜢(*Melanoplus*)屬、群居蚱蜢(*Schistocerca gregaria*)；以及德國小蠊、美洲大蠊、非洲螻蛄與東亞飛蝗；

屬於蚤目(Siphonaptera)者，例如，蚤(*Ceratophyllus*)屬、東方鼠蚤(*Xenopsylla cheopis*)；

屬於綜合目(Symphyla)者，例如，*Scutigera* *immaculata*；

屬於纓翅目(Thysanoptera)者，例如，稻薊馬(*Baliothrips biformis*)、*Enneothrips flavens*、薊馬(*Frankliniella*)屬、薊馬(*Heliothrips*)屬、溫室條薊馬(*Hercinothrips femoralis*)、*Kakothrips* 屬、腹鉤薊馬(*Rhipiphorothrips cruentatus*)、薊馬(*Scirtothrips*)屬、薊馬屬之 *Taeniothrips cardamoni*、薊馬(*Thrips*)屬；以及南黃薊馬與苜蓿薊馬；

屬於半翅目(Hemiptera)者，例如，黑尾葉蟬、稻褐飛虱、康氏粉蚧、矢尖蚧、桃蚜、蘋果蚜、棉蚜、菜縊管蚜、梨花網蝽、*Nazara* 屬、溫室白粉虱與木虱(*Psylla*)屬；

屬於纓尾目(Thysanura)者，例如，西洋衣魚(*Lepisma saccharina*)；

植物寄生性線蟲包含，例如，種癭線蟲(*Anguina*)屬、葉芽線蟲(*Aphelenchoides*)屬、*Belonoaimus* 屬、松材線蟲(*Bursaphelenchus*)屬、莖線蟲(*Ditylenchus dipsaci*)、包囊

線蟲 (*Globodera*) 屬、*Heliocotylenchus* 屬、包囊線蟲 (*Heterodera*) 屬、長針線蟲 (*Longidorus*) 屬、根瘤線蟲 (*Meloidogyne*) 屬、穿孔線蟲 (*Radopholus similis*)、根腐線蟲屬、螺旋線蟲 (*Rotylenchus*) 屬、殘根線蟲 (*Trichodorus*) 屬、矮化線蟲 (*Tylenchorhynchus*) 屬、墊刃線蟲 (*Tylenchulus*) 屬、柑橘線蟲 (*Tylenchulus semipenetrans*) 屬、劍線蟲 (*Xiphinema*) 屬；以及根瘤線蟲、松材線蟲、水稻白尖病葉芽線蟲、大豆包囊線蟲與根腐線蟲屬；

5 蟎類包括，例如，朱砂葉蟎、二斑葉蟎、柑桔全爪蟎、桔刺皮癭蟎與跗線蟎屬；或例如鈍喙蜉屬、硬蜉屬、蜉屬等。

本發明中，具有對抗包含所有該等害物的害蟲之殺昆蟲效力之物質被稱為殺昆蟲劑。

適當時，於特定濃度或施加率下，根據本發明之化合物亦可作為除草劑、保護劑 (safeners)、生長調節劑或增進植物性質用劑、或作為殺菌劑 [例如殺真菌劑、抗黴菌劑、殺細菌劑、殺病毒劑 (包括對抗類病毒製劑)] 或作為對抗 MLO (擬菌質體) 與 RLO (類立克次體) 之製劑用。適當時，彼等亦可作為合成其他活性化合物之中間產物或前驅物
15 用。
20

於獸醫領域中，本發明之新穎化合物可有效地用於各種有害之動物寄生物 (內寄生物及外寄生物)，包括昆蟲與寄生蟲。

此等動物寄生物之實例可包含下述害蟲：昆蟲，例如

胃蠅屬、螫蠅屬、嚙毛蟲屬、錐鼻蟲屬、犬蚤
(*Ctenocephalides canis*)、臭蟲、貓蚤 (*Ctenocephalides felis*)、綿羊綠蠅 (*Lucilia cuprina*) 等。

如上文已述，於獸醫領域中，亦即於獸醫藥學中，根

5 據本發明之活性化合物具有對抗動物寄生物(特別是外寄
生物或內寄生物)之活性。內寄生物一詞特別包含蛔蟲，例
如條蟲、線蟲或吸蟲、及原生動物例如球蟲。外寄生物典
型地及較佳為節肢動物，特別是昆蟲例如蠅(螫刺及舔舐
性)、寄生性蠅幼蟲、虱、頭虱、鳥虱、蚤等；或蟬蟎類，
10 如碑類例如硬蟬或軟蟬、或蟎類例如疥蟎、秋收恙蟎、鳥
蟎等。

彼等寄生物包括：

屬於虱目 (Anoplurida) 者，例如，獸虱 (*Haematopinus*)
屬、長顎虱 (*Linognathus*) 屬、虱 (*Pediculus*) 屬、*Phtiruss* 屬、
15 *Solenopotes* 屬；特定實例為狗長顎虱 (*Linognathus setosus*)、牘長顎虱 (*Linognathus vituli*)、綿羊長顎虱
(*Linognathus ovillus*)、卵形長顎虱 (*Linognathus oviformis*)、足長顎虱 (*Linognathus pedalis*)、山羊長顎虱
(*Linognathus stenopsis*)、驢盲虱 (*Haematopinus asini*
20 *macrocephalus*)、牛盲虱 (*Haematopinus eurysternus*)、豬盲
虱 (*Haematopinus suis*)、頭虱 (*Pediculus humanus capitis*)、
體虱 (*Pediculus humanus corporis*)、*Phylloera vastatrix*、陰
虱 (*Phthirus pubis*)、吸虱 (*Solenopotes capillatus*)；

屬於食毛目 (Mallophagida) 及鈍角 (Amblycerina) 與細

角亞目 (Ischnocerina) 者，例如，毛鳥虱 (*Trimenopon*) 屬、短角鳥虱 (*Menopon*) 屬、巨毛虱 (*Trinoton*) 屬、羽虱 (*Bovicola*) 屬、咬虱 (*Werneckiella*) 屬、*Lepikentron* 屬、咬虱 (*Damalina*) 屬、獸鳥虱 (*Trichodectes*) 屬、羽虱 (*Felicola*) 屬；特定實例為：牛羽虱 (*Bovicola bovis*)、羊羽虱 (*Bovicola ovis*)、安哥拉山羊羽虱 (*Bovicola limbata*)、牛咬虱 (*Damalina bovis*)、狗羽虱 (*Trichodectes canis*)、貓羽虱 (*Felicola subrostratus*)、山羊羽虱 (*Bovicola caprae*)、*Lepikentron ovis*、馬咬虱 (*Werneckiella equi*)；

屬於雙翅目及長角 (Nematocerina) 與短角亞目 (Brachycerina) 者，例如，伊蚊屬、按蚊屬、庫蚊 (*Culex*) 屬、蚋蠅 (*Simulium*) 屬、*Eusimulium* 屬、糠蚊 (*Phlebotomus*) 屬、沙蠅 (*Lutzomyia*) 屬、蚊 (*Culicoides*) 屬、草蛉 (*Chrysops*) 屬、黑蠅 (*Odagmia*) 屬、黑蠅 (*Wilhelmia*) 屬、瘤虻 (*Hybomitra*) 屬、黃虻 (*Atylotus*) 屬、牛虻 (*Tabanus*) 屬、麻虻 (*Haematopota*) 屬、*Philipomyia* 屬、蜂蠅 (*Braula*) 屬、家蠅 (*Musca*) 屬、齒股蠅 (*Hydrotaea*) 屬、螫蠅 (*Stomoxys*) 屬、血蠅 (*Haematobia*) 屬、*Morellia* 屬、廢蠅 (*Fannia*) 屬、舌蠅 (*Glossina*) 屬、麗蠅 (*Calliphora*) 屬、綠蠅 (*Lucilia*) 屬、麗蠅 (*Chrysomyia*) 屬、污蠅 (*Wohlfahrtia*) 屬、麻蠅 (*Sarcophaga*) 屬、狂蠅 (*Oestrus*) 屬、皮蠅 (*Hypoderma*) 屬、胃蠅 (*Gastrophilus*) 屬、虱蠅 (*Hippobosca*) 屬、*Lipoptena* 屬、虱蠅 (*Melophagus*) 屬、鼻蠅 (*Rhinoestrus*) 屬、大蚊 (*Tipula*) 屬；特定實例為：埃及伊蚊、白伊蚊 (*Aedes albopictus*)、黑伊蚊 (*Aedes*

taeniorhynchus)、甘比亞按蚊(*Anopheles gambiae*)、五斑按蚊(*Anopheles maculipennis*)、紅頭麗蠅、*Chrysozona pluvialis*、五帶淡色庫蚊(*Culex quinquefasciatus*)、尖音庫蚊、媒斑蚊(*Culex tarsalis*)、黃腹廢蠅(*Fannia canicularis*)、肉蠅(*Sarcophaga carnaria*)、螫蠅(*Stomoxys calcitrans*)、歐洲大蚊、綿羊綠蠅、絲光綠蠅(*Lucilia sericata*)、蚋蠅屬之 *Simulium reptans*、糠蚊屬之 *Phlebotomus papatasi*、尖頭糠蚊(*Phlebotomus longipalpis*)、華麗黑蠅(*Odagmia ornate*)、黑蠅屬之 *Wilhelmia equina*、*Boophthora erythrocephala*、牛虻屬之 *Tabanus bromius*、*Tabanus spodopterus*、黑牛虻(*Tabanus atratus*)、*Tabanus sudeticus*、瘤虻屬之 *Hybomitra ciurea*、草蛉屬之 *Chrysops caecutiens*、*Chrysops relictus*、雨生麻虻(*Haematopota pluvialis*)、義大利麻虻(*Haematopota italica*)、秋家蠅(*Musca autumnalis*)、家蠅、騷擾角蠅(*Haematobia irritans irritans*)、騷擾角蠅(*Haematobia irritans exigua*)、牛血蠅(*Haematobia stimulans*)、刺激齒股蠅(*Hydrotaea irritans*)、烏麗齒股蠅(*Hydrotaea albipuncta*)、銅尾金蠅(*Chrysomya chloropyga*)、蛆症金蠅(*Chrysomya bezziana*)、羊鼻蠅(*Oestrus ovis*)、牛皮蠅(*Hypoderma bovis*)、紋皮蠅(*Hypoderma lineatum*)、山羊皮瘤蠅(*Przhevalskiana silenusa*)、人膚蠅、綿羊虱蠅(*Melophagus ovinus*)、*Lipoptena capreoli*、*Lipoptena cervi*、斑麗虱蠅(*Hippobosca variegata*)、馬虱蠅(*Hippobosca*

equine)、大馬胃蠅(*Gasterophilus intestinalis*)、赤尾胃蠅(*Gasterophilus haemorroidalis*)、胃蠅屬之 *Gasterophilus inermis*、馬鼻胃蠅(*Gasterophilus nasalis*)、黑角胃蠅(*Gasterophilus nigricornis*)、獸類胃蠅(*Gasterophilus pecorum*)、蜂蝨屬之 *Braula coeca*；

屬於蚤目(Siphonapterida)者，例如，蚤(*Pulex*)屬、頭蚤(*Ctenocephalides*)屬、鼠蚤(*Xenopsylla*)屬、蚤(*Ceratophyllus*)屬；特定實例為：犬蚤、貓蚤、人蚤(*Pulex irritans*)、穿皮潛蚤(*Tunga penetrans*)、東方鼠蚤；

10 屬於異翅亞目者，例如，臭蟲(*Cimex*)屬、獵蝽(*Triatoma*)屬、錐蝽(*Rhodnius*)屬、錐鼻蟲(*Panstrongylus*)屬；

屬於蜱蟯目者，例如，東方蜱蟯、美洲大蜱、德國小蜱、蜱蟯(*Supella*)屬[例如長鬚蜱蟯(*Supella longipalpa*)]；

15 屬於蜱蟯目(Acarina)及後胸-與中胸氣門目者，例如，隱喙蜱(*Argas*)屬、鈍喙蜱屬、殘喙蜱(*Otobius*)屬、硬蜱屬、花蜱(*Amblyomma*)屬、牛蜱屬、革蜱(*Dermacentor*)屬、血蜱(*Haemophysalis*)屬、璃眼蜱(*Hyalomma*)屬、刺蟎(*Dermanyssus*)屬、扇頭蜱(*Rhipicephalus*)屬(多種宿主牛蜱類之原屬)、禽刺蟎(*Ornithonyssus*)屬、肺恙蟲

20 (*Pneumonyssus*)屬、*Railletia* 屬、蟎蟲(*Sternostoma*)屬、瓦蟎(*Varroa*)屬、壁虱(*Acarapis*)屬；特定實例為：雞壁蝨(*Argas persicus*)、鴿壁蝨(*Argas reflexus*)、非洲鳥壁蝨(*Ornithodoros moubata*)、耳殘喙蜱(*Otobius megnini*)、微小扇頭蜱(牛蜱)[*Rhipicephalus (Boophilus) microplus*]、淡

色扇頭蜱(牛蜱)[*Rhipicephalus (Boophilus) decoloratus*]、
 環紋扇頭蜱(牛蜱)[*Rhipicephalus (Boophilus) annulatus*]、
 扇頭蜱(牛蜱)屬之 *Rhipicephalus (Boophilus) calceratus*、
 璃眼蜱屬之 *Hyalomma anatolicum*、埃及璃眼蜱(*Hyalomma*
 5 *aegypticum*)、環狀璃眼蜱(*Hyalomma marginatum*)、灰白璃
 眼蜱(*Hyalomma transiens*)、外翻扇頭蜱(*Rhipicephalus*
evertsi)、蓖麻硬蜱(*Ixodes ricinus*)、六角硬蜱(*Ixodes*
hexagonus)、犬硬蜱(*Ixodes canisuga*)、硬蜱(*Ixodes*
pilosus)、紅硬蜱(*Ixodes rubicundus*)、肩突硬蜱(*Ixodes*
 10 *scapularis*)、全環硬蜱(*Ixodes holocyclus*)、嗜群血蜱
 (*Haemaphysalis concinna*)、斑點血蜱(*Haemaphysalis*
punctata)、朱紅血蜱(*Haemaphysalis cinnabarina*)、血蜱屬
 之 *Haemaphysalis otophila*、利奇血蜱(*Haemaphysalis*
leachi)、長角血蜱(*Haemaphysalis longicorni*)、厚邊革蜱
 15 (*Dermacentor marginatus*)、網狀革蜱(*Dermacentor*
reticulatus)、革蜱屬之 *Dermacentor pictus*、白花革蜱
 (*Dermacentor albipictus*)、安氏矩頭蜱(*Dermacentor*
andersoni)、美洲犬蜱(*Dermacentor variabilis*)、北非璃眼
 蜱(*Hyalomma mauritanicum*)、血紅扇頭蜱(*Rhipicephalus*
 20 *sanguineus*)、囊扇頭蜱(*Rhipicephalus bursa*)、扇頭蜱屬之
Rhipicephalus appendiculatus、好望角扇頭蜱
 (*Rhipicephalus capensis*)、扇頭蜱屬之 *Rhipicephalus*
turanicus、*Rhipicephalus zambeziensis*、美洲花蜱
 (*Amblyomma americanum*)、花蜱屬之 *Amblyomma*

variegatum、海灣花蜱(*Amblyomma maculatum*)、花蜱屬之
Amblyomma hebraeum、卡晏花蜱(*Amblyomma cajennense*)、雞皮刺蟎、囊禽刺蟎(*Ornithonyssus bursa*)、
 禽刺蟎屬之 *Ornithonyssus sylviarum*、雅氏瓦蟎(*Varroa jacobsoni*)；

屬於輻蟎目(Actinedida)前氣門亞目(Prostigmata)與粉
 蟎亞目(Acaridida)無氣門亞目(Astigmata)者，例如，壁虱
 屬、姬螯蟎(*Cheyletiella*)屬、*Ornithocheyletia* 屬、*Myobia*
 屬、*Psorergates* 屬、蠕形蟎(*Demodex*)屬、恙蟎(*Trombicula*)
 10 屬、*Listrophorus* 屬、粉蟎(*Acarus*)屬、酪蟎(*Tyrophagus*)
 屬、嗜木蟎(*Caloglyphus*)屬、*Hypodectes* 屬、*Pterolichus*
 屬、癢蟎(*Psoroptes*)屬、皮恙蟎(*Chorioptes*)屬、疥癬
 (*Otodectes*)屬、疥蟎(*Sarcoptes*)屬、疥癬(*Notoedres*)屬、疥
 蟎(*Knemidocoptes*)屬、*Cytodites* 屬、*Laminosioptes* 屬；特
 15 定實例為：恙蟎(*Cheyletiella yasguri*)、姬螯蟎屬之
Cheyletiella blakei、犬蠕形蟎(*Demodex canis*)、牛蠕形蟎
 (*Demodex bovis*)、綿羊蠕形蟎(*Demodex ovis*)、山羊蠕形蟎
 (*Demodex caprae*)、馬蠕形蟎(*Demodex equi*)、蠕形蟎屬之
Demodex caballi、*Demodex suis*、秋收恙(*Neotrombicula*
 20 *autumnalis*)、*Neotrombicula desaleri*、*Neoschöngastia*
xerothermobia、紅恙蟎(*Trombicula akamushi*)、耳疥蟲
 (*Otodectes cynotis*)、貓疥癬(*Notoedres cati*)、犬疥蟎
 (*Sarcoptes canis*)、牛疥蟎(*Sarcoptes bovis*)、羊疥蟎
 (*Sarcoptes ovis*)、羚羊疥蟎(*Sarcoptes rupicaprae*)(=S.

caprae)、馬疥蟎(*Sarcoptes equi*)、猪疥蟎(*Sarcoptes suis*)、羊癢蟎(*Psoroptes ovis*)、耳癢蟎(*Psoroptes cuniculi*)、馬癢蟎(*Psoroptes equi*)、牛皮恙蟎(*Chorioptes bovis*)、羊皮恙蟎(*Psoergates ovis*)、獸鼻疥蟲、犬鼻疥蟲(*Pneumonyssoides caninum*)、伍氏壁虱(*Acarapis woodi*)。

根據本發明之活性化合物亦適用於防治侵襲動物之節肢動物、蛔蟲及原生動物；以節肢動物之防治較佳；特佳為防治昆蟲；同樣特佳為防治蜱蟎類。可被處理以防治寄生物之動物包括鳥類、昆蟲及特別是哺乳動物。動物包含農業家畜舉例而言，如，牛、綿羊、山羊、馬、豬、驢、駱駝、水牛、兔、雞、生毛的動物、火雞、鴨、鵝、人工養殖魚、蜜蜂。再者，動物包括馴養動物 - 亦為所謂伴侶動物 - 舉例而言，如，狗、貓、雪貂、籠中鳥、蓄養魚、爬蟲類及所謂試驗動物，舉例而言，如，倉鼠、天竺鼠、大鼠及小鼠。

藉由防治彼等節肢動物、蛔蟲及原生動物，意欲減少宿主動物之死亡及增進其表現(例如肉、乳、毛、獸皮、蛋、蜂蜜等生產)，因此使用根據本發明之活性化合物使更經濟及簡易之動物飼養成為可能。

例如，一般期望防止或干擾寄生物攝取宿主血液(適當時)。同時，防治寄生物有助於防止傳染物質之傳遞。

本文所用之「防治」一詞於有關獸醫領域時，係意指活性化合物可有效地減少被該等寄生物感染的動物中各別寄生物之發生至無害之程度。詳言之，本文所用之「防治」

意指活性化合物可有效地殺害各別寄生物、抑制其生長、或抑制其增殖。

本發明之活性化合物，於作為殺昆蟲劑用時，可調配為習知調配劑形式。該等調配劑形式包括，例如溶液、乳
5 液、可濕性粉劑、水可分散之粒劑、懸浮液、粉劑、泡沫物、糊劑、錠劑、粒劑、氣溶膠、與活性化合物一起浸漬之天然及合成物物質、微膠囊、種子塗覆劑、與燃燒裝置(燃燒裝置包括，例如燻蒸及煙燻匣、罐與線圈)及 UVL [冷霧、溫霧]一起使用之調配劑。

10 本發明之式(I)或式(Ia)活性化合物可呈市售可得調配劑，及以彼等調配劑製成使用形式，呈與其他活性化合物(例如殺昆蟲劑、毒餌、殺細菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、殺真菌劑、生長調節劑、除草劑等)之混合調配劑形式存在。上述殺昆蟲劑可包括，例如，有機磷製劑、胺基甲酸酯製
15 劑、羧酸酯化學劑、氣煙型化學劑、由微生物產生之殺昆蟲物質等。

彼等調配劑可利用本質上已知之方法製備；例如，彼等可利用使活性化合物與擴展劑(spreading agents)，亦即液體稀釋劑或載劑、液化氣體稀釋劑或載劑、固體稀釋劑
20 或載劑，及視需要使用界面活性劑亦即乳化劑及/或分散劑及/或泡沫形成劑混合予以製備。

使用水作為擴展劑時，舉例而言，可使用有機溶劑作為輔助溶劑。

液體稀釋劑或載劑可包括，例如，芳族烴(例如二甲

苯、甲苯、烷基萘等)；氯化芳族或氯化脂族烴(例如氯苯類、二氯乙烷類、二氯甲烷類等)；脂族烴(例如環己烷類或鏈烷烴(例如礦油餾份))；醇類(例如丁醇、乙二醇及其醚類或酯類等)；酮類(例如丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮、環己酮等)；強極性溶劑(例如二甲基甲醯胺、二甲亞

5 砒等)；水等。

液化氣體稀釋劑或載劑可包括室溫及常壓下呈氣體存在之物質，例如，氣溶膠推進劑如呋喃、丙烷、氮氣、二氧化碳、鹵化烴。

10 固體稀釋劑可包括，例如，細磨之天然礦物(例如高嶺土、黏土、滑石粉、白堊、石英、綠坡縷石、蒙脫土或矽藻土等)；細磨之合成礦物(例如高度分散之矽酸、氧化鋁、矽酸鹽等)等。

15 用於粒劑之固體載劑可包括，例如，經壓碎與分級之岩石(例如方解石、大理石、浮石、海泡石、白雲石等)；無機或有機粉劑之合成粒劑；有機物料(例如鋸屑、椰殼、玉米穗、印第安野草稈)之細粒劑。

20 乳化劑及/或泡沫形成劑可包括，例如，非離子性或陰離子性乳化劑(例如聚氧乙烯脂肪酸酯類、聚氧乙烯脂肪醇醚類(例如烷基芳基聚乙二醇醚類)、烷基磺酸酯類、烷基硫酸酯類、芳基磺酸酯類等)；白蛋白水解物等。

分散劑之實例包括，例如，木質素亞磺酸廢液、甲基纖維素等。

調配劑(粉劑、粒劑、乳液)中亦可使用黏著劑，例如

羧甲基纖維素；天然或合成聚合物(例如阿拉伯膠、聚乙烯醇類、聚乙酸乙烯酯類等)等。

亦可使用著色劑，例如無機色素(例如氧化鐵、氧化鈦、普魯士藍等)；有機色料(例如茜素色料、偶氮色料或金屬酞菁色料)以及微量元素(例如鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬或鋅等鹽)。

該等調配劑通常含有 0.1 至 95%重量比不等，較佳為 0.5 至 90%重量比不等之上述活性化合物。

根據本發明之化合物可以適用於其施用形式之一般方法使用。一般將瞭解，根據本發明之化合物亦可呈含進一步組成(例如輔助劑或活性成分)之組成物存在。熟習此項技藝者將從本文列舉及此項技藝已知者中選擇應可提升被認為對意指施加及用途有利用之性質之組成。

所有植物與部分植物體均可根據本發明予以處理。於本說明書中，植物欲被瞭解為意指所有植物與植物族群，例如需要及不為所欲之野生植物或作物植物(包括天然存在之作物植物)。作物植物為可利用習知植物育種及最適方法或利用生物技術與遺傳工程方法或這些方法之組合法獲得之植物，包括基因轉殖植物及受或不受植物育種者之權利保護之植物栽培品種。部分植物體欲被瞭解為意指植物之所有地上與地下部分及器官，例如苗、葉、花與根，可述及之實例為葉、針、柄、莖、花、果實體、果實、種子、根、塊莖與根莖。部分植物體亦包含經收獲之物料，及無性與有性繁殖物料，例如幼苗、塊莖、根莖、插條及種子。

根據本發明，以活性化合物處理植物及部分植物體係直接進行或利用習知處理法，例如利用浸漬、噴霧、蒸發、生霧、撒播、上漆、注射及於繁殖物料(特別是種子)之情形下，利用施敷一或多個塗層，令化合物作用於其環境、棲息處或貯存場所。

如上述，所有植物及部分植物體均可能根據本發明予以處理。於較佳具體實例中，係處理野生植物及植物栽培品種、或利用習知生物育種方法(例如雜交或原生質體融合)獲得者、及部分植物體。於進一步較佳具體實例中，則處理利用遺傳工程方法(適當時，則與習知方法組合)獲得之基因轉移植物及植物栽培品種(基因改造生物)，及部分植物體。「部分」或「部分植物體」等詞已於上文說明。

特佳為，根據本發明處理於各情形下市售可得或使用中之植物栽培品種之植物。植物栽培品種欲被瞭解為意指具有新穎性質(「特性」)及係利用習知育種法、利用突變誘發法或利用重組 DNA 技術獲得之植物，其可為栽培品種、生物-或基因型。

視植物種類或栽培品種、其位置及生長條件(土壤、氣候、植被期、養料)而定，根據本發明之處理亦可產生超增加(「增效」)之效果。例如，超越實際預期效果之施加率減少及/或活性譜擴張及/或根據本發明可使用之諸物質與組成物之活性提高、植物生長較佳、對高溫或低溫之耐性增加、對乾旱或對水或土壤鹽含量之耐性增加、花開得多、易於收割、加速成熟、收穫率較高、品質較佳及/或收成產

物營養價值較高、貯存安定性及/或收成產物加工性較佳等均可能發生。

擬根據本發明處理之較佳基因轉移植物或植物栽培品種(以遺傳工程方法獲得者)包含藉由基因改造得到賦與該等植物特別有利、有用特性之遺傳物質之所有植物。此等特性之實例為植物生長較佳、對高溫或低溫之耐性增加、對乾旱或對水或土壤鹽含量之耐性增加、花開得多、易於收割、加速成熟、收穫率較高、品質較佳及/或收成產物營養價值較高、貯存性質及/或收成產物加工性較佳。此等特性之進一步及特別著重之實例為植物對抗動物及微生物害物(例如對抗昆蟲、蟬蟎、植物病原真菌、細菌及/或病毒)之防禦力較佳、以及植物對特定具除草活性化合物之耐性增加。可述及之基因轉移植物之實例為重要收成作物，例如穀類(小麥、稻)、玉米、大豆、馬鈴薯、糖用甜菜、番茄、豌豆與其他蔬菜品種、棉花、煙草、芸苔以及水果作物(蘋果、梨、柑橘類水果與葡萄)，特別是玉米、大豆、馬鈴薯、棉花、煙草及芸苔。特別著重之特性為由於在植物中形成毒素—特別是由得自蘇雲金芽孢桿菌之遺傳物質[例如由 CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb 與 CryIF 等基因以及其組合物]而於植物中形成毒素，使植物對昆蟲、蛛形綱動物、線蟲與蛭蟪及蝸牛之防禦力增加(下文稱為「Bt 植物」)。又特別著重之特性為由於後天獲得之系統抗性(SAR)、系統素(systemin)、植物防禦素(phytoalexins)、誘

引劑與抗性基因及對應之表現蛋白與毒素，使植物對真菌、細菌及病毒之防禦力增加。進一步特別著重之特性為植物對特定具除草活性化合物[例如咪唑啉酮類、磺酰脲類、嘉磷塞(glyphosate)或次膦酰麥黃酮(例如“PAT”基因)]
5 之耐性增加。賦與論及之所需特性之基因亦可互相組合而存在基因轉移植物中。可述及之「Bt 植物」實例為以商品名 YIELD GARD®(例如玉米、棉花、大豆)、KnockOut®(例如玉米)、StarLink®(例如玉米)、Bollgard®(棉花)、Nucotn®(棉花)及 NewLeaf®(馬鈴薯)出售之玉米品種、棉花品種、大豆品種及馬鈴薯品種。可述及之對除草劑具耐性植物之實例為以商品名 Roundup Ready®(對嘉磷塞具耐性，例如玉米、棉花、大豆)、Liberty Link®(對次膦酰麥黃酮具耐性，例如芸苔)、IMI®(對咪唑啉酮類具耐性)及 STS®(對磺酰脲類具耐性，例如玉米)出售之玉米品種、棉花品種及大豆品種。可述及之對除草劑具耐性之植物(以習知方法針對除草劑耐性育種之植物)包含以商品名 Clearfield®(例如玉米)出售之品種。當然，彼等敘述亦可應用於具有此等遺傳特性或仍待開發之遺傳特性之植物栽培品種，該等植物未來將開發及/或上市。

20 所列植物可以特別有利之方法，使用根據本發明之化合物或組成物，根據本發明予以處理。上述活性化合物或組成物之較佳範圍亦可應用於彼等植物之處理。特別著重者為於以本文詳述之化合物或組成物進行之植物處理。

再者，頃發現根據本發明之化合物對於破壞工業物料

的昆蟲亦具有強力之殺昆蟲作用。

下文列舉可述及昆蟲之較佳實例，惟不擬構成任何局限：

甲蟲類，例如家天牛、毛天牛(*Chlorophorus pilosis*)、

- 5 家具竊蠹、紅毛竊蠹(*Xestobium rufovillosum*)、*Ptilinus pecticornis*、*Dendrobium pertinex*、粉竊蠹(*Ernobius mollis*)、*Priobium carpini*、歐洲竹粉蠹(*Lyctus brunneus*)、非洲粉蠹(*Lyctus africanus*)、平頸粉蠹(*Lyctus planicollis*)、*Lyctus linearis*、濃毛粉蠹(*Lyctus pubescens*)、
- 10 *Trogoxylon aequale*、鱗毛粉蠹(*Minthes rugicollis*)、小蠹(*Xyleborus*)屬、小蠹(*Trypodendron*)屬、咖啡黑長蠹(*Apate monachus*)、長蠹屬之 *Bostrychus capucins*、*Heterobostrychus brunneus*、雙棘長蠹(*Sinoxylon*)屬、竹長蠹(*Dinoderus minutus*)；

- 15 膜翅目昆蟲例如藍黑樹蜂(*Sirex juvencus*)、大樹蜂(*Urocerus gigas*)、泰加大樹蜂(*Urocerus gigas taignus*)、*Urocerus augur*；

- 白蟻例如木白蟻屬之 *Kaloterms flavicollis*、麻頭砂白蟻(*Cryptoterms brevis*)、*Heteroterms indicola*、黃胸散白蟻(*Reticulitermes flavipes*)、網紋白蟻屬之 *Reticulitermes santonensis*、南歐網紋白蟻(*Reticulitermes lucifugus*)、澳洲白蟻(*Mastoterms darwiniensis*)、古白蟻屬之 *Zootermopsis nevadensis*、臺灣家白蟻；
- 20

繯尾蟲例如西洋衣魚。

於本說明書中，工業物料擬被瞭解為意指無生命之物料例如，較佳為，塑料、黏著劑、膠黏物、紙與板、皮革、木頭、經加工處理之木頭產品及塗層組成物。

適當時，則該等立即可用之組成物可進一步含有殺蟲劑，適當時，為一或多種殺真菌劑。

關於可能之附加添加劑，可參考上文述及之殺蟲劑及殺真菌劑。

根據本發明之化合物同樣可用於保護與海水或微鹹水接觸之物體，特別是船身、隔板、網製品、建造物、停泊處及信號系統，以防止污染。

再者，單獨或與其他活性化合物組合使用之根據本發明之化合物可作為防污劑用。

於家畜、保健及貯存產品保護上，該等活性化合物亦適用於防治動物害物，特別是在包圍空間例如住宅、工廠通道、辦公室、艙位等處發現的昆蟲、蜘蛛及蟎；彼等可於家用殺昆蟲劑產物中單獨或組合其他活性化合物與輔助劑使用，以防治害物；彼等對於敏感及有抗性之品系，及對於所有發育階段均具活性。彼等害物包括：

屬於蠍目(Scorpionidea)者，例如，地中海黃蠍(*Buthus occitanus*)；

屬於蟬蟎目者，例如，雞壁蝨、鴿壁蝨、苔蟎(*Bryobia*)屬、雞皮刺蟎、住家食甜恙蟲(*Glyciphagus domesticus*)、非洲鳥壁蝨(*Ornithodoros moubat*)、血色扇頭蝨蟲、刺激秋恙蟲(*Trombicula alfreddugesi*)、*Neutrombicula*

autumnalis 、 歐洲 家 刺 皮 蟎 (*Dermatophagoides pteronissimus*)、美洲家刺皮蟎(*Dermatophagoides forniae*)；

屬於蜘蛛目(Araneae)者，例如，*Aviculariidae*、圓蛛科(*Araneidae*)；

- 5 屬於盲蛛目(Opiliones)者，例如，擬蝎屬之 *Pseudoscorpiones chelifer*、*Pseudoscorpiones cheiridium*、盲蛛屬之 *Opiliones phalangium*；

屬於等足目者，例如，海蛆屬之 *Oniscus asellus*、*Porcellio scaber*；

- 10 屬於雙足目者，例如，*Blaniulus guttulatus*、山蛭蟲(*Polydesmus*)屬；

屬於唇足目者，例如，地蜈蚣屬；

屬於衣魚亞目(Zygentoma)者，例如，衣魚(*Ctenolepisma*)屬、西洋衣魚、盜火蟲(*Lepismodes* 15 *inquilinus*)；

屬於蜚蠊目者，例如，東方蜚蠊、德國小蠊、亞洲蟑螂(*Blattella asahinai*)、馬得拉蜚蠊、蜚蠊(*Panchlora*)屬、蜚蠊(*Parcoblatta*)屬、澳洲大蠊(*Periplaneta australasiae*)、美洲大蠊、褐色大蠊(*Periplaneta brunnea*)、20 煙色大蠊(*Periplaneta fuliginosa*)、長鬚蜚蠊(*Supella longipalpa*)；

屬於跳躍亞目(Saltatoria)者，例如，家蟋蟀；

屬於革翅目者，例如，歐洲球蝨；

屬於等翅目者，例如，木白蟻屬、網白蟻屬；

屬於啮蟲目(Psocoptera)者，例如，書蝨(*Lepinatus*)屬、書蝨(*Liposcelis*)屬；

屬於鞘翅目者，例如，皮蠹(*Anthrenus*)屬、黑皮蠹(*Attagenus*)屬、皮蠹(*Dermestes*)屬、長頭穀盜(*Latheticus oryzae*)、郭公蟲(*Necrobia*)屬、蜘蛛甲屬、穀蠹、穀象(*Sitophilus granarius*)、米象(*Sitophilus oryzae*)、玉米象、藥材甲蟲(*Stegobium paniceum*)；

屬於雙翅目者，例如，埃及伊蚊、白伊蚊、黑伊蚊、按蚊屬、紅頭麗蠅、*Chrysozona pluvialis*、五帶淡色庫蚊、尖音家蚊、媒斑蚊、果蠅屬、黃腹廢蠅、家蠅、糠蚊(*Phlebotomus*)屬、肉蠅、蚋蠅(*Simulium*)屬、螫蠅、歐洲大蚊；

屬於鱗翅目者，例如，小蠟螟(*Achroia grisella*)、大蠟螟、印度穀螟(*Plodia interpunctella*)、衣蛾屬之 *Tinea cloacella*、網衣蛾、袋衣蛾；

屬於蚤目者，例如，犬蚤、貓蚤、人蚤、穿皮潛蚤、東方鼠蚤；

屬於膜翅目者，例如，大黑蟻(*Camponotus herculeanus*)、黑草蟻(*Lasius fuliginosus*)、普通黑蟻(*Lasius niger*)、*Lasius umbratus*、廚蟻、*Paravespula* 屬、鋪道蟻(*Tetramorium caespitum*)；

屬於虱目者，例如，頭虱、體虱、*Pemphigus* 屬、*Phylloera vastatrix*、陰虱；

屬於異翅亞目者，例如，熱帶臭蟲(*Cimex*

hemipterus)、臭蟲(*Cimex lectularius*)、錐蝨(*Rhodnius prolixus*)、騷擾錐蝨(*Triatoma infestans*)。

於家用殺昆蟲劑領域中，可使用及尤其較佳為使用與其他適當活性化合物(例如磷酸酯類、胺基甲酸酯類、擬除蟲菊酯類、新類尼古丁劑、生長調節劑或得自其他已知殺昆蟲劑類別之活性化合物)之組合物。

根據本發明之化合物或組成物，較佳為呈其適當施用形式，用於氣溶膠、無壓力之噴霧產品(例如泵送及噴霧器噴霧物)、自動生霧系統、生霧器(foggers)、泡沫、凝膠、具有以纖維素或聚合物製成的蒸發器錠劑之蒸發器產物、液體蒸發器、凝膠及膜蒸發器、由推進器驅動之蒸發器、無能量或被動蒸發系、蛾紙、蛾袋與蛾膠，或呈粒劑或細粉劑、供撒佈之餌料或於置餌處使用。

根據本發明之化合物或組成物特別適用於處理種子。由害物引發之對作物植物之傷害極大部分發生於最早期，種子於貯存期間、於被引入土壤中後、其間及在植物發芽後即被侵襲；此階段特別具關鍵性，因為生長中植物的根與幼芽特別敏感，即使小傷害亦可導致整株植物死亡。因此使用適當組成物以保護種子及發芽中之植物特別受到關注。

藉處理植物種子以防治害物長久以來已為業界悉知，主要問題在於持續改善。然而，種子之處理常常產生無法以令人滿意的方式解決之一系列問題。因此，業界期盼開發出於播種或植物萌芽後不需額外施加作物保護劑之用於

保護種子與發芽植物之方法；進一步期盼使用最適量之活性化合物以對種子與發芽植物提供最大保護而免害物侵襲，惟所用活性化合物不傷害植物本身。特別是，種子處理方法亦須將基因轉殖植物固有之殺昆蟲性質列入考量，
5 以期使用最少量作物保護劑而達成對種子以及發芽植物之最適保護。

因此，本發明特別亦係有關藉使用根據本發明之組成物處理種子，以保護種子與發芽植物免受害物侵襲之方法。本發明同樣有關使用根據本發明之組成物處理種子，
10 以保護種子與發芽植物免受害物侵襲之用途。再者，本發明乃有關已使用根據本發明之組成物處理而提供防禦害物之保護之種子。

本發明之一優點在於根據本發明組成物之特定滲體性質意指經彼等組成物處理之種子不僅保護種子本身，亦保護萌芽後產生之植物免受害物侵襲。於此方法中，可免除
15 播種時或其後對作物之立即處理。

再者，必須列入考量之優點為，根據本發明之化合物或組成物亦可用於特別是基因轉殖種子，由此種子產生之植物能表現被指引對抗害物之蛋白質。藉使用根據本發明
20 組成物處理此等種子，則僅經由表現，例如，該殺昆蟲蛋白，即可防治特定害物，及附加地使其受根據本發明組成物保護而免受傷害。

根據本發明之化合物或組成物適用於保護農業、溫室、森林或園藝上使用之上文已述及之任何植物品種之種

子；特別是，為種子形式之玉米、花生、油菜花、芸苔、
罌粟、大豆、棉花、甜菜(例如糖用甜菜與飼料甜菜)、稻、
高粱與小米、小麥、大麥、燕麥、黑麥、向日葵、煙草、
馬鈴薯或蔬菜(例如番茄、甘藍菜作物)。根據本發明之組
5 成物同樣適用於處理已如上述之水果及蔬菜作物之種子；
其中以玉米、大豆、棉花、小麥及油菜花或芸苔種子之處
理特具重要性。

如上述，使用根據本發明組成物處理基因轉殖種子亦
具特別重要性；其係呈植物種子之形式，通常，含有至少
10 一個決定多肽(具有殺昆蟲性質)表現之異源基因。於本說
明書中，基因轉殖種子之該異源基因可衍生自例如桿菌
(*Bacillus*)、根瘤菌(*Rhizobium*)、假單胞菌(*Pseudomonas*)、沙雷氏菌
(*Serratia*)、木黴菌(*Trichoderma*)、棒狀桿菌(*Clavibacter*)、菌根菌(*Glomus*)
或膠狀青黴菌(*Gliocladium*)等微生物。本發明特別適用於處理
15 含有源自桿菌屬之至少一種異源基因及其基因產物具有對
抗歐洲玉米螟及/或玉米根蟲活性之基因轉殖種子；以衍生
自蘇雲金芽胞桿菌(*Bacillus thuringiensis*)之異源基因為特
佳。

於本發明說明書中，根據本發明之組成物係單獨或呈
20 適當調配劑施敷於種子。較佳為，種子呈穩定而足以避免
於處理期間受傷害之狀態被處理。一般而言，種子可於收
割及播種間之任何時間點處理。所用種子通常已與植物分
離且未攙雜果實之穗軸、果莢、柄、表皮、毛或果肉。

處理種子時，通常必須很謹慎，俾使所選定施加於種

子之根據本發明組成物之量及/或進一步添加劑之量對種子發芽無不利影響，或者產生之植物不受傷害。特別在特定施加量之活性化合物可能具有植物毒害效應之情形下，更須牢記在心。

5 本發明之活性化合物用於對抗保健害物及貯存穀物害物時，於鈣質物質上具有對鹼之良好穩定性；在木頭與土壤中亦顯示極佳之殘留活性。

10 此外，本發明之式(I)或式(Ia)活性化合物可呈與增效劑之混合調配劑存在，此等調配劑與使用形式可包括商業上有用之調配劑與形式。該等增效劑，本身不必然具有活性，乃增進活性化合物作用之化合物。

一般而言，用於處理動物時，可直接施加根據本發明之活性化合物；較佳為彼等係呈醫藥組成物(可含此項技藝中已知之醫藥上可接受之賦形劑及/或輔助劑)進行施加。

15 於獸醫領域及動物飼養中，活性化合物係以已知方式，呈例如錠劑、膠囊、飲劑、獸用藥水、粒劑、糊劑、大丸劑、餵飼法、栓劑等形式經腸投與；利用，例如肌內、皮下、靜脈內、腹膜內等注射、植入施加而進行非經腸投與；經鼻投與；呈例如浸泡或浸漬、噴霧、澆注與點上、
20 沖洗與撒粉、以及藉助於含活性化合物之模製用品例如項圈、耳籤、尾籤、四肢繫帶、韁繩、標記裝置等形式經皮投與。活性化合物亦可調配為洗髮精或呈可用於氣溶膠、不加壓噴霧劑(例如唧筒噴霧劑與霧化器噴霧劑)之適當調配劑。

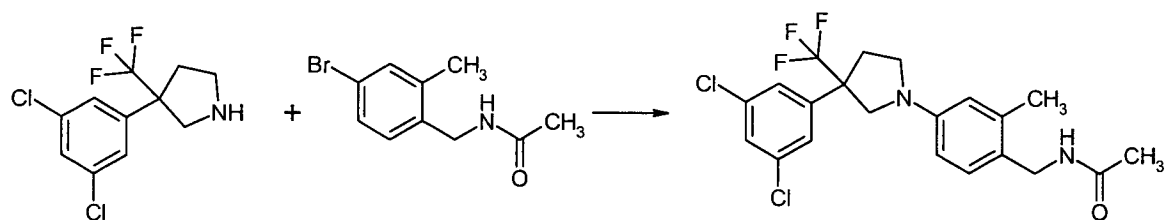
用於家畜、家禽、馴養動物等時，根據本發明之活性化合物可呈活性化合物含量為 1 至 80 重量%之調配劑(例如粉劑、可濕性粉劑[“WP”]、乳液、可乳化濃縮物[“EC”]、流動性物質、均質溶液及懸浮液濃縮物[“SC”])，直接或於
5 稀釋(例如 100 至 10 000 倍稀釋)後，或者呈化學浴施用。

用於獸醫領域時，根據本發明之活性化合物可組合適當增效劑或其他活性化合物(舉例而言，如，殺蟎劑、殺昆蟲劑、驅蟲劑、抗原生動物藥物)使用。

茲藉由下述實例更具體說明本發明；然而，本發明絕
10 不擬受限於彼等實例。

合成實例 1

N-{4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-甲基苄基}乙醯胺(No.3-11)之合成



15 氫氣氛圍下，添加第三丁醇鈉(0.3 克)、參(二亞苄基丙酮)二鈹(0)(氯仿加合物)(0.04 克)與 Xantphos (0.07 克)至 3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷(0.59 克)與 N-(4-溴-2-甲基苄基)乙醯胺(0.5 克)之甲苯溶液中，此混合物於 80°C，攪拌下，加熱 5 小時。以第三丁基甲基醚稀釋反應
20 溶液，然後以水與鹽水洗滌。其有機層以無水硫酸鎂乾燥；減壓蒸除溶劑，然後利用矽膠層析法純化殘留物，得到 N-{4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-甲基

苄基}乙醯胺(0.6 克)。

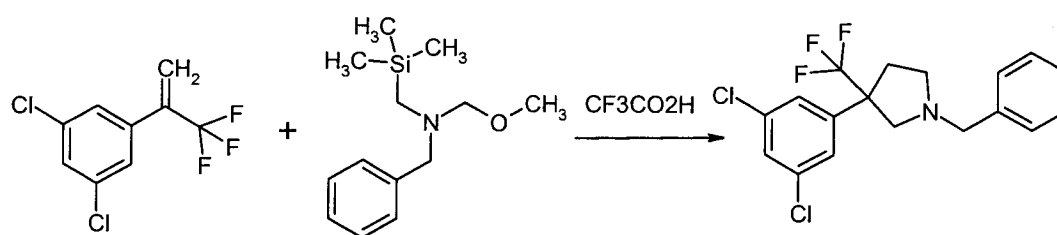
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 2.13-2.18 (6H, m), 2.51-2.53 (1H, m), 2.81-2.83 (1H, m), 3.45-3.56 (2H, m), 3.75-3.78 (1H, m), 4.01-4.04 (1H, m), 4.25 (1H, s), 4.57 (1H, s), 6.40-6.44 (2H, m), 6.93-6.96 (1H, m), 7.30-7.38 (3H, m)。

合成實例 2

4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-硝基-N-(吡啶-2-基甲基)苯甲醯胺 (No.1-16)之合成

合成實例 2-1

10 1-苄基-3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷(No.5-11)之合成

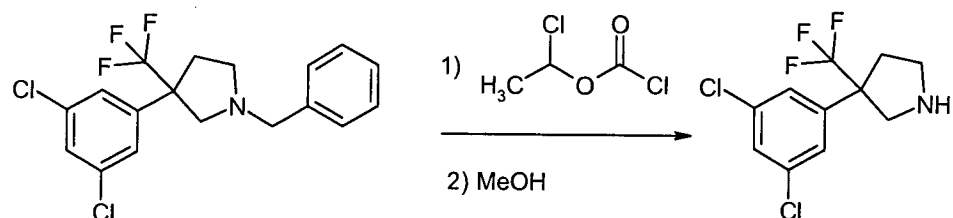


以冰冷卻下，於 1,3-二氯-5-[1-(三氟甲基)乙烯基]苯 (6.1 克)與 N-苄基-1-甲氧-N-[(三甲基矽烷基)甲基]甲胺 (5.0 克)之二氯甲烷溶液中，逐滴添加三氟乙酸(0.24 克)之二氯甲烷溶液。滴加結束後，使混合物回升至室溫，攪拌 3 小時。減壓濃縮該溶液，然後以第三丁基甲基醚稀釋殘留物。此溶液以飽和碳酸氫鈉水溶液洗滌，並以無水硫酸鎂乾燥。過濾去除乾燥劑後，減壓蒸除溶劑，然後利用矽膠層析法純化殘留物，得到 1-苄基-3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷(5.7 克)。 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 2.27-2.36 (1H,

m), 2.53-2.62 (1H, m), 2.69-2.83 (2H, m), 3.08 (2H, dd), 3.67 (2H, s), 7.25-7.36 (8H, m)。

合成實例 2-2

3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷(No.5-12)之合成



5

迴流加熱 1-苄基-3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷(5.7 克)與氯甲酸 1-氯乙酯(4.4 克)之二氯乙烷溶液 3 小時。冷卻此混合物至室溫，然後減壓濃縮。於所得殘留物中添加甲醇，接著於 60°C，攪拌下，加熱兩小時。冷卻此混合物至室溫，於其內添加水。此溶液以己烷與乙酸乙酯(9:1)之混合溶劑洗滌兩次。以碳酸氫鈉鹼化該溶液，然後以乙酸乙酯萃取三次。合併有機層，接著以鹽水洗滌並以無水硫酸鎂乾燥。過濾去除乾燥劑後，減壓蒸除溶劑，得到 3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷(4.2 克)。

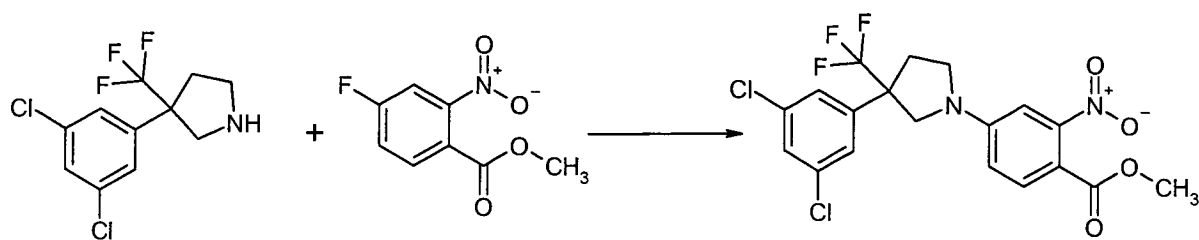
10

15 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 2.24-2.33 (1H, m), 2.51-2.56 (1H, m), 2.97-3.07 (1H, m), 3.19-3.26 (2H, m), 3.74 (1H, d), 7.25 (2H, d), 7.35 (1H, t)。

合成實例 2-3

4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-硝基苯甲酸甲酯(No.4-6)之合成

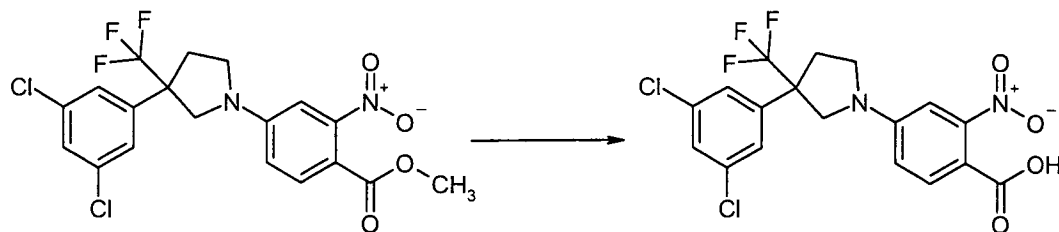
20



於 4-氟-2-硝基苯甲酸甲酯(1.1 克)與 3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷(1.5 克)之 1-甲基-2-吡咯烷酮溶液中，添加碳酸鉀(1.5 克)，此混合物於 100°C，攪拌下，加熱兩小時。冷卻混合物至室溫，然後將其傾入水中，接著以乙酸乙酯萃取兩次。合併有機層，然後以水洗滌，並以無水硫酸鎂乾燥。過濾去除乾燥劑後，減壓蒸除溶劑，然後利用矽膠層析法純化殘留物，得到 4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-硝基苯甲酸甲酯(1.24 克)。¹H-NMR (CDCl₃) δ: 2.53-2.67 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.50-3.71 (2H, m), 3.83 (1H, d), 3.85 (3H, s), 4.15 (1H, d), 6.69 (1H, dd), 6.75 (1H, d), 7.26 (2H, d), 7.42 (1H, t), 7.81 (1H, d)。

合成實例 2-4

4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-硝基苯甲酸(No. 4-7)之合成

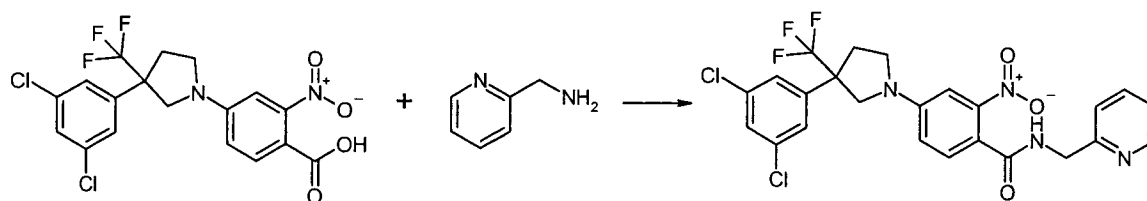


於 4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-硝基苯甲酸甲酯(1.24 克)之 1,4-二噁烷溶液中，添加 2N 氫

氧化鈉水溶液(5.4 毫升)，此混合物於 80°C，攪拌下，進行加熱。冷卻此混合物至室溫，以 2N 鹽酸予以酸化後，混合物以乙酸乙酯萃取。合併有機層，然後以水洗滌，並以無水硫酸鎂乾燥。過濾去除乾燥劑後，減壓蒸除溶劑，得到 4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-硝基苯甲酸(0.85 克)。¹H-NMR (DMSO-d₆) δ: 2.58-2.72 (1H, m), 2.91-3.04 (1H, m), 3.47-3.57 (2H, m), 3.87 (1H, d), 4.32 (1H, d), 6.86 (1H, dd), 7.04 (1H, d), 7.65 (2H, d), 7.71 (1H, t), 7.78 (1H, d)。

10 合成實例 2-5

4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-硝基-N-(吡啶-2-基甲基)苯甲醯胺(No.1-16)之合成

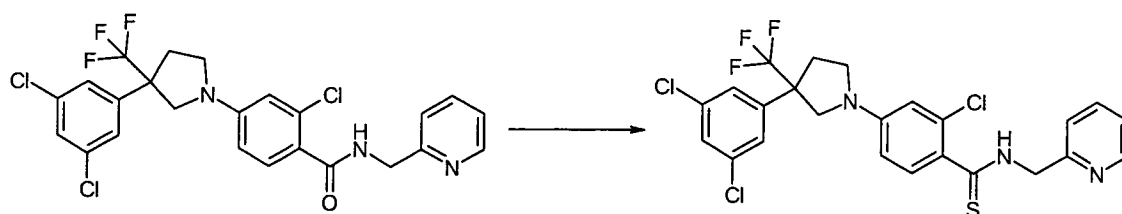


於 4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-硝基苯甲酸(0.3 克)與 2-吡啶基甲胺(0.07 克)之 DMF 溶液中，添加 1-乙基-3-(3'-二甲胺基丙基)碳化二亞胺鹽酸鹽(0.13 克)與 1-羥基苯并三唑單水合物(0.01 克)，此混合物於室溫攪拌 6 小時。將反應溶液傾入水中，接著以乙酸乙酯萃取兩次。合併有機層，然後以水洗滌，並以無水硫酸鎂乾燥。過濾去除乾燥劑後，減壓蒸除溶劑，然後利用矽膠層析法純化殘留物，得到 4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-硝基-N-(吡啶-2-基甲基)苯甲醯胺(0.19

克)。¹H-NMR (CDCl₃) δ: 2.54-2.65 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.51-3.67 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.13 (1H, d), 4.74 (2H, d), 6.75 (1H, dd), 7.08 (1H, d), 7.15-7.23 (2H, m), 7.28 (2H, br s), 7.37 (1H, d), 7.41 (1H, t), 7.49 (1H, d), 7.70 (1H, td), 8.52 (1H, d)。

合成實例 3

2-氯-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-N-(吡啶-2-基甲基)苯硫羰胺(No.1-81)



於 2-氯-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-N-(吡啶-2-基甲基)苯甲醯胺(0.35 克)之甲苯溶液中，添加拉威森試劑(0.28 克)，迴流加熱此混合物 3 小時。冷卻此混合物至室溫後，減壓蒸除溶劑，其殘留物利用矽膠層析法進行純化，得到 2-氯-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-N-(吡啶-2-基甲基)苯硫羰胺(0.10 克)。

¹H-NMR (CDCl₃) δ: 2.51-2.61 (1H, m), 2.84-2.92 (1H, m), 3.45-3.61 (2H, m), 3.79 (1H, d), 4.08 (1H, d), 5.08 (2H, d), 6.49-6.54 (2H, m), 7.22-7.28 (3H, m), 7.36 (1H, d), 7.40 (1H, t), 7.72 (1H, td), 7.79 (1H, d), 8.54 (1H, d), 9.27 (1H, br s)。

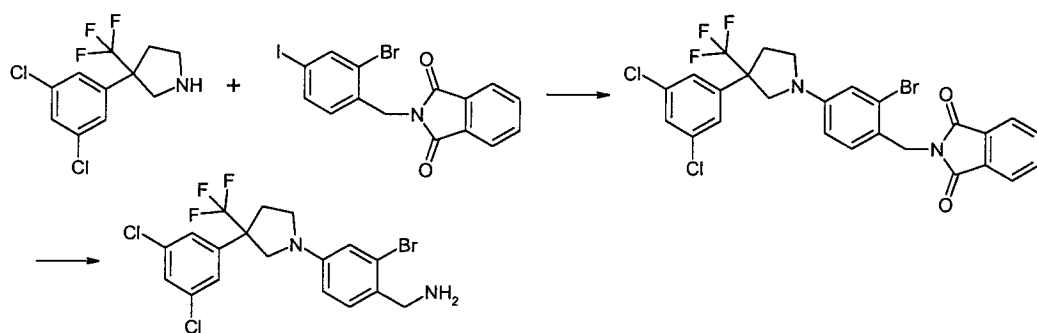
20 合成實例 4

N-{2-氯-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苄

基}乙醯胺(No.3-3)之合成

合成實例 4-1

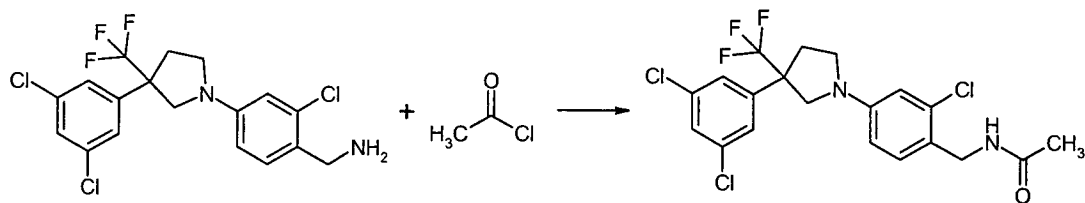
1-{2-氯-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苯基}甲胺(No.4-49)之合成



氫氣氛圍下，添加第三丁醇鈉(0.2 克)、參(二亞苄基丙酮)二鈹(0) (氯仿加合物)(0.03 克)與 Xantphos (0.05 克)至 3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷(0.4 克)與 2-(2-氯-4-碘苄基)-1H-異吲哚-1,3-(2H)-二酮 (0.69 克)之甲苯溶液中，此混合物於 80°C，攪拌下，加熱 3 小時。以第三丁基甲基醚稀釋反應溶液，然後以水與鹽水洗滌；其有機層以無水硫酸鎂乾燥。減壓蒸除溶劑，得到粗產物。使該產物溶於甲醇中，於其內添加胼水溶液(0.03 克)，隨後迴流加熱此混合物 12 小時。以第三丁基甲基醚稀釋反應溶液，然後以飽和鹽水洗滌；其有機層以無水硫酸鎂乾燥。減壓蒸除溶劑，然後利用矽膠層析法純化殘留物，得到 1-{2-氯-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苯基}甲胺(0.12 克)。¹H-NMR (CDCl₃) δ: 2.47-2.54 (1H, m), 2.78-2.85 (1H, m), 3.46-3.49 (2H, m), 3.69-4.01 (4H, m), 6.47-6.50 (1H, m), 6.73-6.76 (1H, m), 7.25-7.35 (4H, m)。

合成實例 4-2

N-{2-氯-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苄基}乙醯胺(No.3-3)之合成



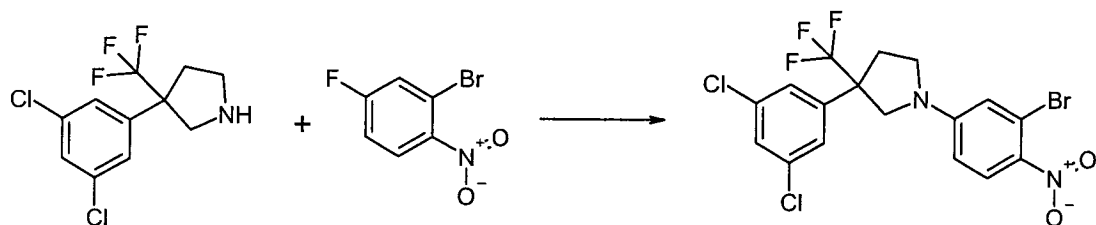
- 5 於 1-{2-氯-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苄基}甲胺(0.12 克)與三乙胺(0.04 克)之四氫呋喃溶液中，逐滴添加乙醯氯(0.02 克)，此混合物於室溫攪拌一小時。以第三丁基甲基醚稀釋反應溶液，然後以水與鹽水洗滌；其有機層以無水硫酸鎂乾燥。減壓蒸除溶劑，然後
- 10 利用矽膠層析法純化殘留物，得到 N-{2-氯-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苄基}乙醯胺(0.1 克)。
- $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.98-2.01 (3H, m), 2.50-2.58 (1H, m), 2.82-2.87 (1H, m), 3.45-3.51 (2H, m), 3.74 (1H, d), 4.02 (1H, d), 4.41 (2H), 6.43-6.46 (1H, m), 6.58-6.59 (1H, m),
- 15 7.26-7.38 (4H, m)。

合成實例 5

1-{2-溴-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苄基}-1H-四唑(No.2-23)之合成

合成實例 5-1

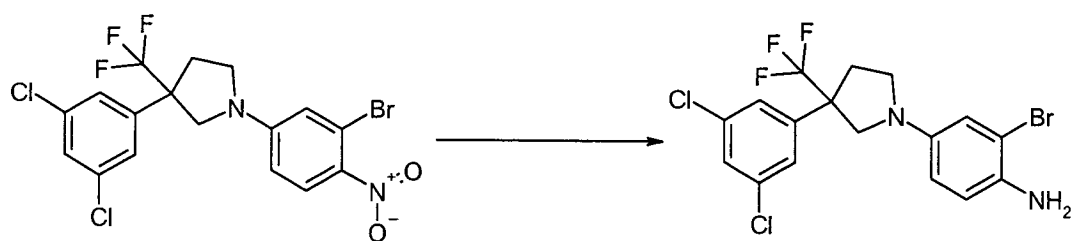
- 20 1-(溴-4-硝苯基)-3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷(No.4-20)之合成



於 3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷(1.3 克)與 2-
 5 溴-4-氟-1-硝基苯(1.0 克)之 1-甲基-2-吡咯烷酮溶液中，添
 加碳酸鉀(1.3 克)，此混合物於 100°C，攪拌下，加熱 3 小
 時。冷卻混合物至室溫，然後將其傾入水中，以乙酸乙酯
 予以萃取。合併有機層，然後以水洗滌，並以無水硫酸鎂
 乾燥。過濾去除乾燥劑後，減壓蒸除溶劑，然後利用矽膠
 層析法純化殘留物，得到 1-(3-溴-4-硝基苯基)-3-(3,5-二氯苯
 基)-3-(三氟甲基)吡咯烷(1.56 克)。¹H-NMR (CDCl₃) δ：
 10 2.53-2.66 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.51-3.71 (2H, m),
 3.83 (1H, d), 4.16 (1H, d), 6.53 (1H, dd), 6.84 (1H, d), 7.27
 (2H, br s), 7.42 (1H, t), 8.07 (1H, d)。

合成實例 5-2

2-溴-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)-吡咯烷-1-基]苯胺
 15 (No.4-21)之合成

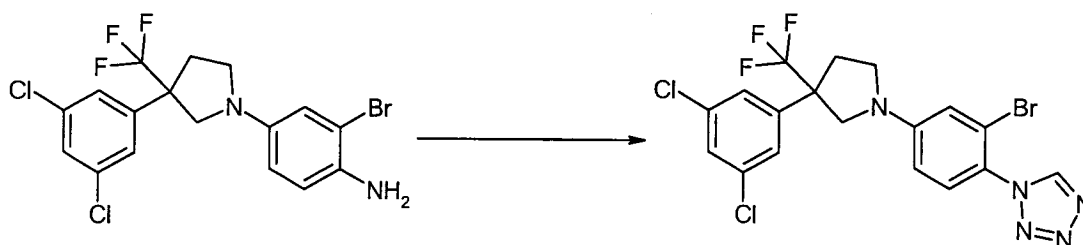


於 1-(3-溴-4-硝基苯基)-3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)
 吡咯烷(1.10 克)之 1,4-二噁烷與乙醇混合溶劑溶液中，添
 加氯化亞錫二水合物(2.05 克)與少量濃鹽酸，接著於 90°C

攪拌此混合物 4 小時。冷卻混合物至室溫，然後將其傾入
 乙酸乙酯與水之混合溶液中，接著於激烈攪拌下，以碳酸
 氫鈉予以中和。通過矽藻土過濾沉澱後，分離有機層，水
 層以乙酸乙酯萃取。合併有機層，接著以鹽水洗滌並以無
 5 水硫酸鎂乾燥。過濾去除乾燥劑後，減壓蒸除溶劑，然後
 利用矽膠層析法純化殘留物，得到 2-溴-4-[3-(3,5-二氯苯
 基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苯胺(0.73 克)。¹H-NMR
 (CDCl₃) δ: 2.44-2.54 (1H, m), 2.75-2.83 (1H, m), 3.32-3.50
 (2H, m), 3.56-3.76 (3H, m), 3.92 (1H, d), 6.46 (1H, dd),
 10 6.70-6.78 (2H, m), 7.29 (2H, br s), 7.37 (1H, t)。

合成實例 5-3

1-{2-溴-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苯
 基}-1H-四唑(No.2-23)之合成



15 於 2-溴-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]
 苯胺(0.60 克)、原甲酸三乙酯(0.98 克)與疊氮化鈉(0.38 克)
 之混合物中，添加乙酸(1.1 克)，然後於 100°C，攪拌下，
 加熱該混合物 4 小時。冷卻混合物至室溫，然後將其傾入
 水中，接著以乙酸乙酯萃取兩次。合併有機層，然後以水
 20 洗滌，並以無水硫酸鎂乾燥。過濾去除乾燥劑後，減壓蒸
 除溶劑，然後利用矽膠層析法純化殘留物，得到 1-{2-溴

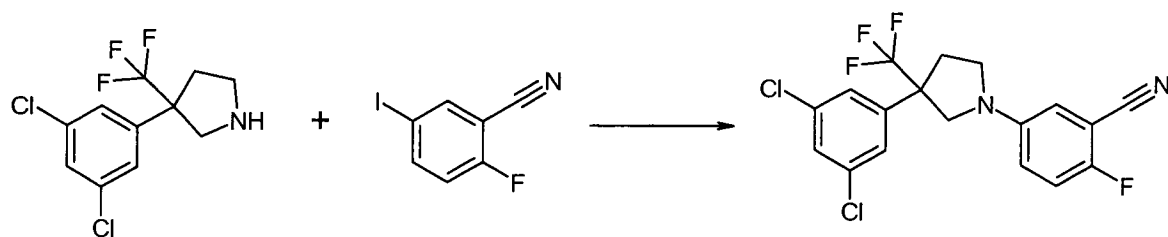
-4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苯基}-1H-四唑(0.52 克)。熔點 193-194°C。

合成實例 6

5-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)苯甲腈 (No.2-39)之合成

合成實例 6-1

5-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-氟苯甲腈 (No.4-17)之合成

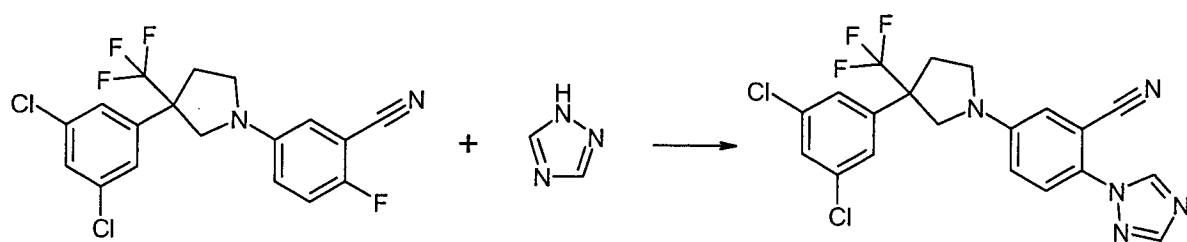


10 使 3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷(0.6 克)與 2-
 15 氟-5-碘苯甲腈(0.57 克)溶於甲苯中，接著進行 3 次脫氣。
 氬氣氛圍下，於此甲苯溶液中添加第三丁醇鈉(0.20 克)、
 參(二亞苄基丙酮)二鈹氯仿複合物(0.04 克)與 Xantphos
 (0.07 克)，此混合物於 80°C 攪拌兩小時。冷卻混合物至室
 溫，接著以乙酸乙酯稀釋，然後以水洗滌，並以無水硫酸
 鎂乾燥。過濾去除乾燥劑後，減壓蒸除溶劑，然後利用矽
 膠層析法純化殘留物，得到 5-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲
 基)吡咯烷-1-基]-2-氟苯甲腈(0.54 克)。熔點 184-186°C。

合成實例 6-2

20 5-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-

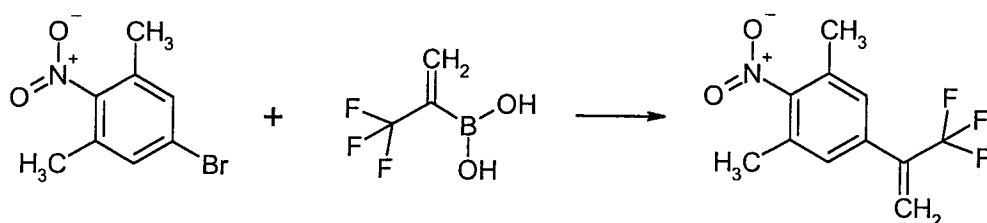
基]-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)苯甲腈(No.2-39)之合成



以冰冷卻下，於 1H-1,2,4-三唑(0.06 克)之 DMF 溶液中，添加氫化鈉(0.04 克)，使混合物回升至室溫，然後攪拌 0.5 小時。於此溶液中，添加 5-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-氟苯甲腈(0.30 克)之 DMF 溶液，迴流加熱此混合物 6 小時。冷卻混合物至室溫，然後將其傾入水中，接著以乙酸乙酯萃取兩次。合併有機層，然後以水洗滌，並以無水硫酸鎂乾燥。過濾去除乾燥劑後，減壓蒸除溶劑，然後利用矽膠層析法純化殘留物，得到 5-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)苯甲腈(0.18 克)。¹H-NMR (DMSO-d₆) δ : 2.62-2.73 (1H, m), 2.95-3.03 (1H, m), 3.49-3.55 (2H, m), 3.90 (1H, d), 4.31 (1H, d), 7.09 (1H, dd), 7.29 (1H, d), 7.61 (1H, d), 7.68 (2H, d), 7.71 (1H, t), 8.26 (1H, s), 8.98 (1H, s)。

合成實例 7

1,3-二甲基-2-硝基-5-[1-(三氟甲基)乙烯基]苯(No.6-1)之合成

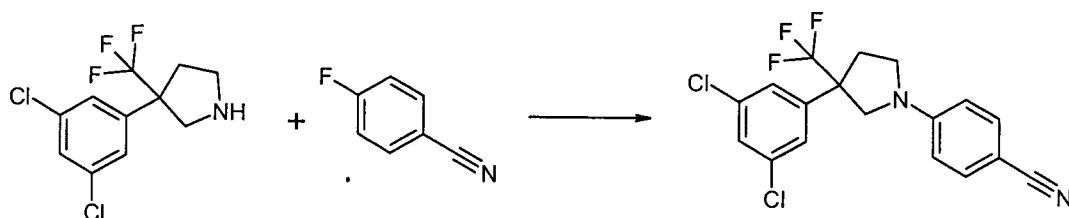


使 5-溴-1,3-二甲基-2-硝基苯(10.0 克)、[1-(三氟甲基)乙烯基]硼酸(純度：60%，13.4 克)與碳酸鉀(14.4 克)溶於 THF 與水之混合溶劑中，接著進行三次脫氣。氬氣氛圍下，
 5 於此溶液中添加二氯雙(三苯基膦)鉀(II)(1.5 克)，迴流加熱此混合物 3 小時。冷卻混合物至室溫，然後將其傾入水中，接著以乙酸乙酯萃取兩次。合併有機層，然後以水洗滌，並以無水硫酸鎂乾燥。過濾去除乾燥劑後，減壓蒸除溶劑，然後利用矽膠層析法純化殘留物，得到 1,3-二甲基-2-硝基
 10 -5-[1-(三氟甲基)乙烯基]苯(11.2 克)。

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 2.34 (6H, s), 5.78-5.80 (1H, m), 6.03-6.04 (1H, m), 7.20 (2H, s)。

合成實例 8

4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苯甲腈
 15 (No.4-2)之合成



於 3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷(0.30 克)與 4-
 氟苯甲腈(0.12 克)之 DMSO (二甲亞砜)溶液中，添加碳酸
 鉀(0.27 克)，此混合物於 120°C ，攪拌下，加熱 6 小時。
 20 冷卻混合物至室溫，然後將其傾入水中，接著以乙酸乙酯

萃取兩次。合併有機層，然後以水洗滌，並以無水硫酸鎂乾燥。過濾去除乾燥劑後，減壓蒸除溶劑，然後利用矽膠層析法純化殘留物，得到 4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]苯甲腈(0.05 克)。

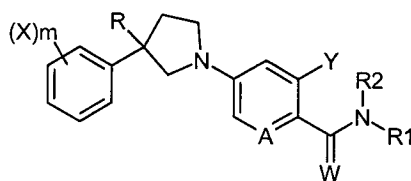
- 5 $^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 2.51-2.62 (1H, m), 2.86-2.94 (1H, m), 3.56-3.61 (2H, m), 3.80 (1H, d), 4.12 (1H, d), 6.59 (2H, d), 7.26 (2H, br s), 7.41 (1H, t), 7.52 (2H, d)。

利用與上述合成實例相同方法及根據上文詳細敘述之方法製得之本發明式(I)或式(Ia)化合物與中間產物，以及
10 其物理數值均示於表 1 至 13。上述合成實例製得之各化合物亦顯示於各對應之表中。

於彼等表中，係使用下述縮寫。

- Me: 甲基； Et: 乙基； Pr: 丙基； Bu: 丁基； Ph: 苯基； Pen: 戊基； m.p.: 熔點； -di:- 二； -tri:- 三； pyridyl: 吡啶基；
15 1-(1-ethylpyrrolidin-2-yl): 1-(1-乙基吡咯烷-2-基)；
n-: 正-； iso-: 異-； cyclo-: 環-； ter-: 第三-； i-: 異-；
vinyl: 乙烯基； propargyl: 炔丙基。

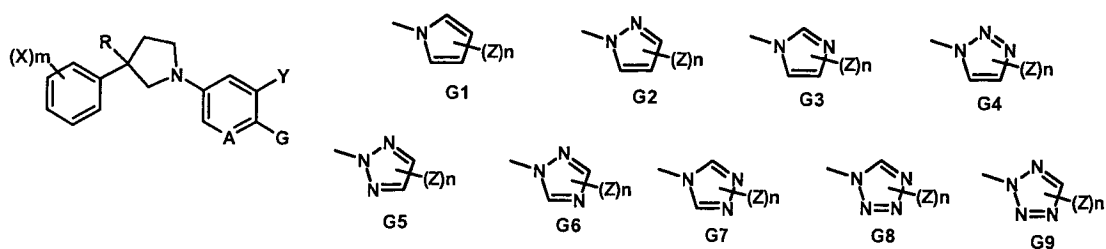
表 1



	(X)m	R	Y	R1	R2	A	W	m.p.(°C)
1-1	3,5-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	
1-2	3,5-diCl	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-3	3,5-diCl	CF3	CH3	CF3CH2	H	CH	O	
1-4	3,5-diCl	CF3	CH3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-5	3,5-diCl	CF3	F	CF3CH2	H	CH	O	
1-6	3,5-diCl	CF3	F	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-7	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3CH2	H	CH	O	
1-8	3,5-diCl	CF3	Cl	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-9	3,5-diCl	CF3	Br	CF3CH2	H	CH	O	
1-10	3,5-diCl	CF3	Br	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-11	3,5-diCl	CF3	Br	cyclo-Pr	H	CH	O	
1-12	3,5-diCl	CF3	Br	NCCH2CH2	H	CH	O	
1-13	3,5-diCl	CF3	I	CF3CH2	H	CH	O	
1-14	3,5-diCl	CF3	I	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-15	3,5-diCl	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-16	3,5-diCl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-17	3-Cl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-18	3-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-19	3-Br	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-20	3-CF3	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	169-170
1-21	3-CF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-22	3,5-diCF3	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-23	3,5-diCF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-24	3-NO2	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	176-179
1-25	3,5-diCl	CF3	CF3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-26	3,5-diCl	CF3	CH3O	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-27	3,5-diCl	CF3	CN	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-28	3,5-diCl	CF3	CF3O	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-29	3,5-diCl	CF3	CH3S	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-30	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-31	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-32	3,5-diCl	CF3	CF3S	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-33	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-34	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-35	3,5-diCl	CF3	OH	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-36	3,5-diCl	CF3	SH	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-37	3,5-diCl	CF3	NH2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-38	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-39	3,5-diCl	CF3	NHCOCF3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-40	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-41	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-42	3-CH3	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-43	3-CH3O	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-44	3-CN	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-45	3-CF3O	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-46	3-CH3S	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-47	3-CH3S(O)	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-48	3-CH3S(O)2	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-49	3-CF3S	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-50	3-CF3S(O)	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-51	3-CF3S(O)2	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-52	3-OH	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-53	3-SH	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-54	3,4-diCl	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	

	(X)m	R	Y	R1	R2	A	W	m.p. (°C)
1-55	3,4-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	77-80
1-56	3,4,5-triCl	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-57	3,4,5-triCl	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	
1-58	3,5-diBr	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-59	3,5-diBr	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	
1-60	3,5-diMe-4-NO2	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-61	3,5-diMe-4-NO2	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	
1-62	3,5-diCl	CF3	H	2-PyridylCH2	H	CH	S	
1-63	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	CH	O	
1-64	3,5-diCl	CF3	NO2	Me	H	CH	O	
1-65	3,5-diCl	CF3	NO2	iso-Pr	H	CH	O	
1-66	3,5-diCl	CF3	NO2	PhCH2	H	CH	O	
1-67	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CO2CH3	H	CH	O	
1-68	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CONMe	H	CH	O	
1-69	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2(cyclo)Pr	H	CH	O	
1-70	3,5-diCl	CF3	NO2	SO2Me	H	CH	O	
1-71	3,5-diCl	CF3	NO2	SO2CF3	H	CH	O	
1-72	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2=CHCH2	H	CH	O	
1-73	3,5-diCl	CF3	NO2	HCCCH2	H	CH	O	
1-74	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CN	H	CH	O	
1-75	3,5-diCl	CF3	NO2	C(Me)2CH2SCH3	H	CH	O	
1-76	3,5-diCl	CF3	NO2	2-F-Ph	H	CH	O	
1-77	3,5-diCl	CH3	H	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-78	3,5-diCl	CF3	H	2-PyridylCH2	H	N	O	
1-79	3,5-diCl	CF3	H	2-PyridylCH2	CH3	CH	O	
1-80	3-NO2	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-81	3,5-diCl	CF3	Cl	2-PyridylCH2	H	CH	S	
1-82	2-diCl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-83	2,3-diCl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-84	3,5-diCl	CF3	NO2	3-PyridylCH2	H	CH	O	
1-85	3,5-diCl	CF3	NO2	4-PyridylCH2	H	CH	O	
1-86	3,5-diCl	CF3	NO2	2-(6-Cl-pyridyl)CH2	H	CH	O	
1-87	3,5-diCl	CF3	NO2	3-(6-Cl-pyridyl)CH2	H	CH	O	
1-88	3,5-diCl	CF3	NO2	2-PyridinylCH2	H	CH	O	
1-89	3,5-diCl	CF3	NO2	1-(1-ethylpyrrolidin-2-yl)CH2	H	CH	O	
1-90	3,5-diCl	CF3	CF3	CF3CH2	H	CH	O	
1-91	3,5-diCl	CF3	CF3	2-(6-Cl-pyridyl)CH2	H	CH	O	
1-92	3,5-diCl	CF3	NO2	Me2NCH=		CH	O	
1-93	3,5-diCl	CF3	NO2	EtON=CH	H	CH	O	
1-94	3,5-diCl	CF3	C=NOCH3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-95	4-Cl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-96	4-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-97	3,5-diCl	CF3	CN	CF3CH2	H	CH	O	
1-98	3,5-diCl	CF3	CF3	H	H	CH	O	
1-99	3,5-diCF3	CF3	CF3	2-PyridylCH2	H	CH	O	
1-100	3,5-diCF3	CF3	CF3	CF3CH2	H	CH	O	
1-101	3,5-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	N	O	
1-102	3,4,5-triCl	CF3	CF3	2-PyridylCH2	H	CH	O	

表 2

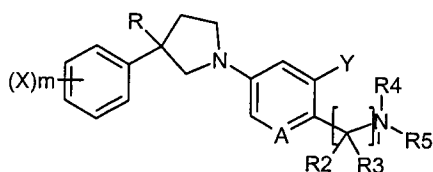


	(X) _m	R	Y	G	Z	A	m.p.(°C)
2-1	3,5-diCl	CF ₃	H	G1	H	CH	
2-2	3,5-diCl	CF ₃	H	G2	H	CH	
2-3	3,5-diCl	CF ₃	H	G3	H	CH	
2-4	3,5-diCl	CF ₃	H	G4	H	CH	
2-5	3,5-diCl	CF ₃	H	G5	H	CH	
2-6	3,5-diCl	CF ₃	H	G6	H	CH	
2-7	3,5-diCl	CF ₃	H	G7	H	CH	
2-8	3,5-diCl	CF ₃	H	G8	H	CH	
2-9	3,5-diCl	CF ₃	H	G9	H	CH	
2-10	3,5-diCl	CF ₃	F	G6	H	CH	
2-11	3,5-diCl	CF ₃	F	G8	H	CH	
2-12	3,5-diCl	CF ₃	F	G9	H	CH	
2-13	3,5-diCl	CF ₃	Cl	G6	H	CH	
2-14	3,5-diCl	CF ₃	Cl	G8	H	CH	
2-15	3,5-diCl	CF ₃	Cl	G9	H	CH	
2-16	3,5-diCl	CF ₃	Br	G1	H	CH	
2-17	3,5-diCl	CF ₃	Br	G2	H	CH	
2-18	3,5-diCl	CF ₃	Br	G3	H	CH	
2-19	3,5-diCl	CF ₃	Br	G4	H	CH	
2-20	3,5-diCl	CF ₃	Br	G5	H	CH	
2-21	3,5-diCl	CF ₃	Br	G6	H	CH	
2-22	3,5-diCl	CF ₃	Br	G7	H	CH	
2-23	3,5-diCl	CF ₃	Br	G8	H	CH	193-194
2-24	3,5-diCl	CF ₃	Br	G9	H	CH	
2-25	3,5-diCl	CF ₃	I	G6	H	CH	
2-26	3,5-diCl	CF ₃	I	G8	H	CH	
2-27	3,5-diCl	CF ₃	I	G9	H	CH	
2-28	3,5-diCl	CF ₃	Me	G6	H	CH	
2-29	3,5-diCl	CF ₃	Me	G8	H	CH	
2-30	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	G6	H	CH	
2-31	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	G8	H	CH	
2-32	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	G6	H	CH	
2-33	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	G8	H	CH	
2-34	3,5-diCl	CF ₃	CN	G1	H	CH	
2-35	3,5-diCl	CF ₃	CN	G2	H	CH	
2-36	3,5-diCl	CF ₃	CN	G3	H	CH	
2-37	3,5-diCl	CF ₃	CN	G4	H	CH	
2-38	3,5-diCl	CF ₃	CN	G5	H	CH	
2-39	3,5-diCl	CF ₃	CN	G6	H	CH	
2-40	3,5-diCl	CF ₃	CN	G7	H	CH	
2-41	3,5-diCl	CF ₃	CN	G8	H	CH	192-193
2-42	3,5-diCl	CF ₃	CN	G9	H	CH	
2-43	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	G6	H	CH	

	(X)m	R	Y	G	Z	A	m.p. (°C)
2-44	3,5-diCl	CF3	NO2	G8	H	CH	
2-45	3,5-diCl	CF3	CH3	G6	H	CH	
2-46	3,5-diCl	CF3	MeS	G6	H	CH	
2-47	3,5-diCl	CF3	MeSO	G6	H	CH	
2-48	3,5-diCl	CF3	MeSO2	G6	H	CH	
2-49	3,5-diCl	CF3	CF3S	G6	H	CH	
2-50	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	G6	H	CH	
2-51	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	G6	H	CH	
2-52	3,5-diCl	CF3	OCH3	G6	H	CH	
2-53	3,5-diCl	CF3	OCF3	G6	H	CH	
2-54	3,5-diCl	CF3	OH	G6	H	CH	
2-55	3,5-diCl	CF3	SH	G6	H	CH	
2-56	3,5-diCl	CF3	NH2	G6	H	CH	
2-57	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	G6	H	CH	
2-58	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	G6	H	CH	
2-59	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	G6	H	CH	
2-60	3,5-diCl	CF3	CN	G2	3-NO2	CH	
2-61	3,5-diCl	CF3	CN	G2	3-CN	CH	
2-62	3,5-diCl	CF3	CN	G6	3-NO2	CH	
2-63	3,5-diCl	CF3	CN	G6	3-CN	CH	
2-64	3,5-diCl	CF3	CN	G2	Cl	CH	
2-65	3,5-diCl	CF3	CN	G2	Br	CH	
2-66	3,5-diCl	CF3	CN	G2	CH3	CH	
2-67	3,5-diCl	CF3	CN	G2	CF3	CH	
2-68	3-Cl	CF3	CN	G6	H	CH	
2-69	3-Cl	CF3	CN	G8	H	CH	
2-70	3-CF3	CF3	CN	G6	H	CH	
2-71	3-CF3	CF3	CN	G8	H	CH	
2-72	3,5-diCF3	CF3	CN	G6	H	CH	
2-73	3,5-diCF3	CF3	CN	G8	H	CH	
2-74	3-NO2	CF3	CN	G6	H	CH	
2-75	3-NO2	CF3	CN	G8	H	CH	
2-76	3,4-diCl	CF3	CN	G6	H	CH	
2-77	3,4-diCl	CF3	CN	G8	H	CH	
2-78	3,5-diBr	CF3	CN	G6	H	CH	
2-79	3,5-diBr	CF3	CN	G8	H	CH	
2-80	3,5-diBr	CF3	Br	G6	H	CH	
2-81	3,5-diBr	CF3	Br	G8	H	CH	
2-82	3,4,5-triCl	CF3	CN	G6	H	CH	
2-83	3,4,5-triCl	CF3	CN	G8	H	CH	
2-84	3,4,5-triCl	CF3	Br	G6	H	CH	
2-85	3,4,5-triCl	CF3	Br	G8	H	CH	
2-86	3,5-diMe-4-NO2	CF3	CN	G8	H	CH	
2-87	3-CH3	CF3	CN	G6	H	CH	
2-88	3-CH3O	CF3	CN	G6	H	CH	
2-89	3-CN	CF3	CN	G6	H	CH	
2-90	3-CF3O	CF3	CN	G6	H	CH	
2-91	3-CF3O	CF3	CN	G8	H	CH	
2-92	3-CH3S	CF3	CN	G6	H	CH	
2-93	3-CH3S	CF3	CN	G8	H	CH	
2-94	3-CH3S(O)	CF3	CN	G6	H	CH	
2-95	3-CH3S(O)2	CF3	CN	G6	H	CH	
2-96	3-CF3S	CF3	CN	G6	H	CH	

	(X)m	R	Y	G	Z	A	m.p. (°C)
2-97	3-CF ₃ S(O)	CF ₃	CN	G6	H	CH	
2-98	3-CF ₃ S(O) ₂	CF ₃	CN	G6	H	CH	
2-99	3-OH	CF ₃	CN	G6	H	CH	
2-100	3-SH	CF ₃	CN	G6	H	CH	
2-101	3,5-diCl	CH ₃	Br	G6	H	CH	
2-102	3,5-diCl	CH ₃	Br	G8	H	CH	
2-103	3,5-diCl	CF ₃	Br	G6	H	N	
2-104	3,5-diCl	CF ₃	Br	G8	H	N	
2-105	3,5-diCl	CF ₃	CN	G6	H	N	
2-106	3,5-diCl	CF ₃	CN	G8	H	N	
2-107	3,5-diCl	CF ₃	C=NOCH ₃	G6	H	CH	
2-108	3,5-diCl	CF ₃	C=NOCH ₃	G8	H	CH	
2-109	3,5-diCl	CF ₃	NHSO ₂ CH ₃	G6	H	CH	
2-110	3,5-diCl	CF ₃	NHSO ₂ CH ₃	G8	H	CH	
2-111	3,5-diCl	CF ₃	NHSO ₂ CF ₃	G6	H	CH	
2-112	3,5-diCl	CF ₃	NHSO ₂ CF ₃	G8	H	CH	

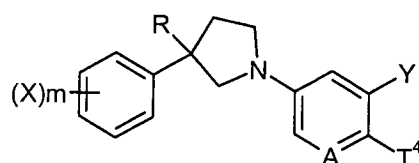
表 3



	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	A	I	m.p. (°C)
3-1	3,5-diCl	CF3	H	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-2	3,5-diCl	CF3	H	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-3	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-4	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-5	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-6	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO(i-Pr)	CH	1	
3-7	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2-pyridyl	CH	1	
3-8	3,5-diCl	CF3	F	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-9	3,5-diCl	CF3	I	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-10	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-11	3,5-diCl	CF3	CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-12	3,5-diCl	CF3	MeS	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-13	3,5-diCl	CF3	MeSO	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-14	3,5-diCl	CF3	MeSO2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-15	3,5-diCl	CF3	CF3S	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-16	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-17	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-18	3,5-diCl	CF3	OCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-19	3,5-diCl	CF3	OCF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-20	3,5-diCl	CF3	OH	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-21	3,5-diCl	CF3	SH	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-22	3,5-diCl	CF3	NH2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-23	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-24	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-25	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCI3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-26	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	CO2-pyridyl	CH	1	
3-27	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	CH	1	
3-28	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Et	COCH3	CH	1	
3-29	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	vinyl	COCH3	CH	1	
3-30	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	propargyl	COCH3	CH	1	
3-31	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2Ph	COCH3	CH	1	
3-32	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CN	COCH3	CH	1	
3-33	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2CF3	COCH3	CH	1	
3-34	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	cycloPr	COCH3	CH	1	
3-35	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	COCH3	COCH3	CH	1	
3-36	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-37	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2F5	CH	1	
3-38	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COPh	CH	1	
3-39	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2-pyridyl	CH	1	
3-40	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CONMe2	CH	1	
3-41	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2Me	CH	1	
3-42	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COSMe	CH	1	
3-43	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	CH	1	
3-44	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	2-pyridylCO	COCH3	CH	1	
3-45	3,5-diBr	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-46	3-Cl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-47	3-CF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-48	3,5-diCF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-49	3,4,5-triCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-50	3,5-diMe-4-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-51	3-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-52	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	N	1	
3-53	3-CH3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-54	3-CH3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-55	3-CN	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-56	3-CF3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-57	3-CH3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-58	3-CH3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-59	3-CH3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-60	3-CF3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-61	3-CF3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-62	3-CF3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	A	I	m.p. (°C)
3-63	3-OH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-64	3-SH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-65	3,5-diCl	CF3	Cl	CN	H	H	COCH3	CH	1	
3-66	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	H	H	COCH3	CH	1	
3-67	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	Me	H	COCH3	CH	1	
3-68	3,5-diCl	CF3	Cl	cyclo-Pr	H	H	COCH3	CH	1	
3-69	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3	H	H	COCH3	CH	1	
3-70	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Me	H	H	COCH3	CH	1	
3-71	3,5-diCl	CF3	Cl	CH=CH2	H	H	COCH3	CH	1	
3-72	3,5-diCl	CF3	Cl	CH2CH2	H	H	COCH3	CH	1	
3-73	3,5-diCl	CF3	Cl	OCH	H	H	COCH3	CH	1	
3-74	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COEt	CH	1	
3-75	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-n	CH	1	
3-76	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-iso	CH	1	
3-77	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COBu-tert	CH	1	
3-78	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCF3	CH	1	
3-79	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh	CH	1	
3-80	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridyl-2	CH	1	
3-81	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridyl-3	CH	1	
3-82	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridylCO-4	CH	1	
3-83	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-2	CH	1	
3-84	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-3	CH	1	
3-85	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-4	CH	1	
3-86	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-2	CH	1	
3-87	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-3	CH	1	
3-88	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-4	CH	1	
3-89	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Br-2	CH	1	
3-90	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Me-2	CH	1	
3-91	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	Covinyl	CH	1	
3-92	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPropargyl	CH	1	
3-93	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	MeSO2	CH	1	
3-94	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CF3SO2	CH	1	
3-95	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONHMe	CH	1	
3-96	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONMe2	CH	1	
3-97	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2Me	CH	1	
3-98	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	C(O)SMe	CH	1	
3-99	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CSMe	CH	1	
3-100	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CON(Me)OMe	CH	1	
3-101	3,5-diCl	CH3	Br	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-102	3,5-diCl	CH3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-103	3,5-diCl	CH3	CN	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-104	3,5-diCl	CH3	NH2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-105	3,5-diCl	CH3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-106	3,5-diCl	CH3	NHCOCF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-107	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-108	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-109	3,5-diCl	CH3	NHSO2CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-110	3,5-diCl	CH3	NHSO2CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-111	3,5-diCl	CH3	C=NOCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-112	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	CH	2	
3-113	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-114	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-115	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COPr-cyclo	CH	1	
3-116	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-117	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-118	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COPr-cyclo	CH	1	
3-119	3,4-diCl, 5-CF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	

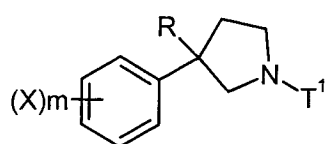
表 4



	(X)m	R	Y	T ⁴	A	m.p.(°C)
4-1	3,5-diCl	CF ₃	H	NO ₂	CH	
4-2	3,5-diCl	CF ₃	H	CN	CH	
4-3	3,5-diCl	CF ₃	H	NH ₂	CH	
4-4	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ Et	CH	161-163
4-5	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ H	CH	
4-6	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-7	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-8	3,5-diCl	CF ₃	NH ₂	CO ₂ Me	CH	
4-9	3,5-diCl	CF ₃	F	CO ₂ Me	CH	
4-10	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Me	CH	
4-11	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Bu-t	CH	
4-12	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ H	CH	
4-13	3,5-diCl	CF ₃	Br	CO ₂ Me	CH	
4-14	3,5-diCl	CF ₃	I	CO ₂ Me	CH	
4-15	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	CO ₂ Me	CH	
4-16	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CH ₃	CH	
4-17	3,5-diCl	CF ₃	CN	F	CH	184-186
4-18	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NO ₂	CH	
4-19	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NH ₂	CH	
4-20	3,5-diCl	CF ₃	Br	NO ₂	CH	
4-21	3,5-diCl	CF ₃	Br	NH ₂	CH	
4-22	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	146-148
4-23	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-24	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-25	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-26	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-27	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-28	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	142-144
4-29	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-30	3,5-diBr	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-31	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-32	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-33	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-34	3-CH ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-35	3-CH ₃ O	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-36	3-CN	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-37	3-CF ₃ O	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-38	3-CH ₃ S	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-39	3-CH ₃ S(O)	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-40	3-CH ₃ S(O) ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-41	3-CF ₃ S	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-42	3-CF ₃ S(O)	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-43	3-CF ₃ S(O) ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-44	3-OH	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-45	3-SH	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-46	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ Me	N	
4-47	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-48	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-49	2-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	

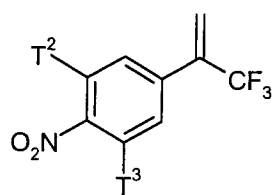
	(X)m	R	Y	T ⁴	A	m.p. (°C)
4-50	2-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-51	4-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-52	4-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-53	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ Et	CH	
4-54	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ H	CH	
4-55	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-56	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-57	3,5-diCl	CF ₃	CN	CO ₂ H	CH	
4-58	3,5-diCl	CF ₃	CN	CO ₂ Me	CH	
4-59	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ Bu-t	N	
4-60	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ H	N	
4-61	3,5-diCF ₃	CF ₃	CF ₃	CO ₂ Et	CH	
4-62	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	F	CH	
4-63	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	NO ₂	CH	
4-64	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	NH ₂	CH	
4-65	3,5-diCl	CF ₃	F	CO ₂ Et	CH	
4-66	3,4,5-triCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ Et	CH	
4-67	3,4,5-triCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ H	CH	

表 5



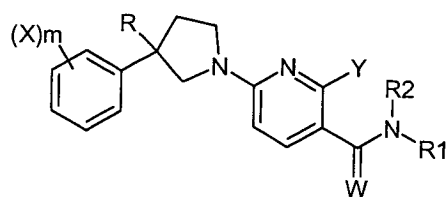
	(X)m	R	T ¹	m.p. (°C)
5-1	2-Cl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-2	2-Cl	CF ₃	H	
5-3	3-Cl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-4	3-Cl	CF ₃	H	
5-5	4-Cl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-6	4-Cl	CF ₃	H	
5-7	2,3-diCl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-8	2,3-diCl	CF ₃	H	
5-9	3,4-diCl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-10	3,4-diCl	CF ₃	H	
5-11	3,5-diCl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-12	3,5-diCl	CF ₃	H	
5-13	3,5-diCl	CF ₃	H, HCl salt	
5-14	3,4,5-triCl	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-15	3,4,5-triCl	CF ₃	H	
5-16	3-CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-17	3-CF ₃	CF ₃	H	
5-18	3,5-diCF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-19	3,5-diCF ₃	CF ₃	H	
5-20	3-Br	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-21	3-Br	CF ₃	H	
5-22	3,5-diBr	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-23	3,5-diBr	CF ₃	H	
5-24	3-NO ₂	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-25	3-NO ₂	CF ₃	H	
5-26	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-27	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	H	
5-28	3-CN	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-29	3-CN	CF ₃	H	
5-30	3-OCF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-31	3-OCF ₃	CF ₃	H	
5-32	3-SCF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-33	3-SCF ₃	CF ₃	H	
5-34	3-S(O)CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-35	3-S(O)CF ₃	CF ₃	H	
5-36	3-S(O) ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-37	3-S(O) ₂ CF ₃	CF ₃	H	
5-38	3,4-diCl, 5-CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-39	3,4-diCl, 5-CF ₃	CF ₃	H	

表 6



	T ²	T ³	m.p. (°C)
6-1	CH ₃	CH ₃	
6-2	CH ₃	CH ₂ CH ₃	
6-3	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	
6-4	n-Pr	n-Pr	
6-5	iso-Pr	iso-Pr	
6-6	cyclo-Pr	cyclo-Pr	
6-7	n-Bu	n-Bu	
6-8	tert-Bu	tert-Bu	
6-9	n-Pen	n-Pen	

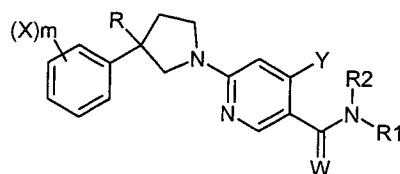
表 7



	(X)m	R	Y	R1	R2	W	m.p.(°C)
7-1	3,5-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	O	
7-2	3,5-diCl	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
7-3	3,5-diCl	CF3	CH3	CF3CH2	H	O	
7-4	3,5-diCl	CF3	CH3	2-PyridylCH2	H	O	
7-5	3,5-diCl	CF3	F	CF3CH2	H	O	
7-6	3,5-diCl	CF3	F	2-PyridylCH2	H	O	
7-7	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3CH2	H	O	
7-8	3,5-diCl	CF3	Cl	2-PyridylCH2	H	O	
7-9	3,5-diCl	CF3	Br	CF3CH2	H	O	
7-10	3,5-diCl	CF3	Br	2-PyridylCH2	H	O	
7-11	3,5-diCl	CF3	Br	cyclo-Pr	H	O	
7-12	3,5-diCl	CF3	Br	NCCH2CH2	H	O	
7-13	3,5-diCl	CF3	I	CF3CH2	H	O	
7-14	3,5-diCl	CF3	I	2-PyridylCH2	H	O	
7-15	3,5-diCl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-16	3,5-diCl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
7-17	3-Cl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
7-18	3-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-19	3-Br	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
7-20	3-CF3	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
7-21	3-CF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-22	3,5-diCF3	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
7-23	3,5-diCF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-24	3-NO2	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
7-25	3,5-diCl	CF3	CF3	2-PyridylCH2	H	O	
7-26	3,5-diCl	CF3	CF3	CF3CH2	H	O	
7-27	3,5-diCl	CF3	CH3O	2-PyridylCH2	H	O	
7-28	3,5-diCl	CF3	CN	2-PyridylCH2	H	O	
7-29	3,5-diCl	CF3	CF3O	2-PyridylCH2	H	O	
7-30	3,5-diCl	CF3	CH3S	2-PyridylCH2	H	O	
7-31	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)	2-PyridylCH2	H	O	
7-32	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)2	2-PyridylCH2	H	O	
7-33	3,5-diCl	CF3	CF3S	2-PyridylCH2	H	O	
7-34	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	2-PyridylCH2	H	O	
7-35	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	2-PyridylCH2	H	O	
7-36	3,5-diCl	CF3	OH	2-PyridylCH2	H	O	
7-37	3,5-diCl	CF3	SH	2-PyridylCH2	H	O	
7-38	3,5-diCl	CF3	NH2	2-PyridylCH2	H	O	
7-39	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	2-PyridylCH2	H	O	
7-40	3,5-diCl	CF3	NHCOCF3	2-PyridylCH2	H	O	
7-41	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	2-PyridylCH2	H	O	
7-42	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	2-PyridylCH2	H	O	
7-43	3-CH3	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
7-44	3-CH3O	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
7-45	3-CN	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
7-46	3-CF3O	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
7-47	3-CH3S	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
7-48	3-CH3S(O)	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
7-49	3-CH3S(O)2	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	

	(X)m	R	Y	R1	R2	W	m.p. (°C)
7-50	3-CF ₃ S	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-51	3-CF ₃ S(O)	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-52	3-CF ₃ S(O) ₂	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-53	3-OH	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-54	3-SH	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-55	3,4-diCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-56	3,4-diCl	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-57	3,4,5-triCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-58	3,4,5-triCl	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-59	3,5-diBr	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-60	3,5-diBr	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-61	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-62	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-63	3,5-diCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	S	
7-64	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	H	H	O	
7-65	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	Me	H	O	
7-66	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	iso-Pr	H	O	
7-67	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	PhCH ₂	H	O	
7-68	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	O	
7-69	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ CONMe	H	O	
7-70	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ (cyclo)Pr	H	O	
7-71	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	SO ₂ Me	H	O	
7-72	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	SO ₂ CF ₃	H	O	
7-73	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ =CHCH ₂	H	O	
7-74	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	HCCCH ₂	H	O	
7-75	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ CN	H	O	
7-76	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	C(Me) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	O	
7-77	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	2-F-Ph	H	O	
7-78	3,5-diCl	CH ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-79	3,5-diCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	CH ₃	O	
7-80	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-81	3,5-diCl	CF ₃	Cl	2-PyridylCH ₂	H	S	
7-82	2-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-83	2,3-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-84	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	3-PyridylCH ₂	H	O	
7-85	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	4-PyridylCH ₂	H	O	
7-86	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	2-(6-Cl-pyridyl)CH ₂	H	O	
7-87	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	3-(6-Cl-pyridyl)CH ₂	H	O	
7-88	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PyridinylCH ₂	H	O	
7-89	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	1-(1-ethylpyrrolidin-2-yl)CH ₂	H	O	
7-90	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-91	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	2-(6-Cl-pyridyl)CH ₂	H	O	
7-92	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	Me ₂ NCH=		O	
7-93	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	EtON=CH	H	O	
7-94	3,5-diCl	CF ₃	C=NOCH ₃	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-95	4-Cl	CF ₃	NO ₂	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-96	4-Cl	CF ₃	NO ₂	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-97	3,5-diCl	CF ₃	CN	CF ₃ CH ₂	H	O	
7-98	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	H	H	O	
7-99	3,5-diCF ₃	CF ₃	CF ₃	2-PyridylCH ₂	H	O	
7-100	3,5-diCF ₃	CF ₃	CF ₃	CF ₃ CH ₂	H	O	

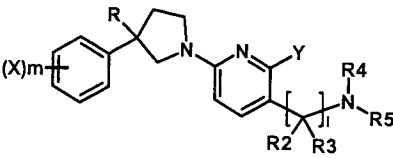
表 8



	(X)m	R	Y	R1	R2	W	m.p. (°C)
8-1	3,5-diCl	CF3	CH3	CF3CH2	H	O	
8-2	3,5-diCl	CF3	CH3	2-PyridylCH2	H	O	
8-3	3,5-diCl	CF3	F	CF3CH2	H	O	
8-4	3,5-diCl	CF3	F	2-PyridylCH2	H	O	
8-5	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3CH2	H	O	
8-6	3,5-diCl	CF3	Cl	2-PyridylCH2	H	O	
8-7	3,5-diCl	CF3	Br	CF3CH2	H	O	
8-8	3,5-diCl	CF3	Br	2-PyridylCH2	H	O	
8-9	3,5-diCl	CF3	Br	cyclo-Pr	H	O	
8-10	3,5-diCl	CF3	Br	NCCH2CH2	H	O	
8-11	3,5-diCl	CF3	I	CF3CH2	H	O	
8-12	3,5-diCl	CF3	I	2-PyridylCH2	H	O	
8-13	3,5-diCl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
8-14	3,5-diCl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
8-15	3-Cl	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
8-16	3-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
8-17	3-Br	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
8-18	3-CF3	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
8-19	3-CF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
8-20	3,5-diCF3	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
8-21	3,5-diCF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
8-22	3-NO2	CF3	NO2	2-PyridylCH2	H	O	
8-23	3,5-diCl	CF3	CF3	2-PyridylCH2	H	O	
8-24	3,5-diCl	CF3	CF3	CF3CH2	H	O	
8-25	3,5-diCl	CF3	CF3	H	H	O	
8-26	3,5-diCl	CF3	CH3O	2-PyridylCH2	H	O	
8-27	3,5-diCl	CF3	CN	2-PyridylCH2	H	O	
8-28	3,5-diCl	CF3	CF3O	2-PyridylCH2	H	O	
8-29	3,5-diCl	CF3	CH3S	2-PyridylCH2	H	O	
8-30	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)	2-PyridylCH2	H	O	
8-31	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)2	2-PyridylCH2	H	O	
8-32	3,5-diCl	CF3	CF3S	2-PyridylCH2	H	O	
8-33	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	2-PyridylCH2	H	O	
8-34	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	2-PyridylCH2	H	O	
8-35	3,5-diCl	CF3	OH	2-PyridylCH2	H	O	
8-36	3,5-diCl	CF3	SH	2-PyridylCH2	H	O	
8-37	3,5-diCl	CF3	NH2	2-PyridylCH2	H	O	
8-38	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	2-PyridylCH2	H	O	
8-39	3,5-diCl	CF3	NHCOCF3	2-PyridylCH2	H	O	
8-40	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	2-PyridylCH2	H	O	
8-41	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	2-PyridylCH2	H	O	
8-42	3-CH3	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
8-43	3-CH3O	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
8-44	3-CN	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
8-45	3-CF3O	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
8-46	3-CH3S	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
8-47	3-CH3S(O)	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
8-48	3-CH3S(O)2	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	
8-49	3-CF3S	CF3	H	2-PyridylCH2	H	O	

	(X)m	R	Y	R1	R2	W	m.p.(°C)
8-50	3-CF ₃ S(O)	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-51	3-CF ₃ S(O) ₂	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-52	3-OH	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-53	3-SH	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-54	3,4-diCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-55	3,4-diCl	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-56	3,4,5-triCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-57	3,4,5-triCl	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-58	3,5-diBr	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-59	3,5-diBr	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-60	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-61	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-62	3,5-diCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	S	
8-63	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	H	H	O	
8-64	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	Me	H	O	
8-65	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	iso-Pr	H	O	
8-66	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	PhCH ₂	H	O	
8-67	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ CO ₂ CH ₃	H	O	
8-68	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ CONMe	H	O	
8-69	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ (cyclo)Pr	H	O	
8-70	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	SO ₂ Me	H	O	
8-71	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	SO ₂ CF ₃	H	O	
8-72	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ =CHCH ₂	H	O	
8-73	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	HCCCH ₂	H	O	
8-74	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CH ₂ CN	H	O	
8-75	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	C(Me) ₂ CH ₂ SCH ₃	H	O	
8-76	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	2-F-Ph	H	O	
8-77	3,5-diCl	CH ₃	H	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-78	3,5-diCl	CF ₃	H	2-PyridylCH ₂	CH ₃	O	
8-79	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-80	3,5-diCl	CF ₃	Cl	2-PyridylCH ₂	H	S	
8-81	2-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-82	2,3-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-83	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	3-PyridylCH ₂	H	O	
8-84	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	4-PyridylCH ₂	H	O	
8-85	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	2-(6-Cl-pyridyl)CH ₂	H	O	
8-86	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	3-(6-Cl-pyridyl)CH ₂	H	O	
8-87	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PyridinylCH ₂	H	O	
8-88	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	1-(1-ethylpyrrolidin-2-yl)CH ₂	H	O	
8-89	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-90	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	2-(6-Cl-pyridyl)CH ₂	H	O	
8-91	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	Me ₂ NCH=		O	
8-92	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	EtON=CH	H	O	
8-93	3,5-diCl	CF ₃	C=NOCH ₃	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-94	4-Cl	CF ₃	NO ₂	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-95	4-Cl	CF ₃	NO ₂	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-96	3,5-diCl	CF ₃	CN	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-97	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	H	H	O	
8-98	3,5-diCF ₃	CF ₃	CF ₃	2-PyridylCH ₂	H	O	
8-99	3,5-diCF ₃	CF ₃	CF ₃	CF ₃ CH ₂	H	O	

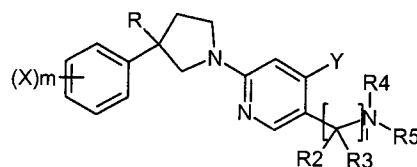
表 9



	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	l	m.p.(°C)
9-1	3,5-diCl	CF3	H	H	H	H	COCH3	1	
9-2	3,5-diCl	CF3	H	H	H	H	COC2H5	1	
9-3	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-4	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	1	
9-5	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COC2H5	1	
9-6	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO(i-Pr)	1	
9-7	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2-pyridyl	1	
9-8	3,5-diCl	CF3	F	H	H	H	COCH3	1	
9-9	3,5-diCl	CF3	I	H	H	H	COCH3	1	
9-10	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	H	COCH3	1	
9-11	3,5-diCl	CF3	CH3	H	H	H	COCH3	1	
9-12	3,5-diCl	CF3	MeS	H	H	H	COCH3	1	
9-13	3,5-diCl	CF3	MeSO	H	H	H	COCH3	1	
9-14	3,5-diCl	CF3	MeSO2	H	H	H	COCH3	1	
9-15	3,5-diCl	CF3	CF3S	H	H	H	COCH3	1	
9-16	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	H	H	H	COCH3	1	
9-17	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	H	H	H	COCH3	1	
9-18	3,5-diCl	CF3	OCH3	H	H	H	COCH3	1	
9-19	3,5-diCl	CF3	OCF3	H	H	H	COCH3	1	
9-20	3,5-diCl	CF3	OH	H	H	H	COCH3	1	
9-21	3,5-diCl	CF3	SH	H	H	H	COCH3	1	
9-22	3,5-diCl	CF3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
9-23	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	1	
9-24	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
9-25	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	1	
9-26	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	CO2-pyridyl	1	
9-27	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
9-28	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Et	COCH3	1	
9-29	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	vinyl	COCH3	1	
9-30	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	propargyl	COCH3	1	
9-31	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2Ph	COCH3	1	
9-32	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CN	COCH3	1	
9-33	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2CF3	COCH3	1	
9-34	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	cycloPr	COCH3	1	
9-35	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	COCH3	COCH3	1	
9-36	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2H5	1	
9-37	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2F5	1	
9-38	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COPh	1	
9-39	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2-pyridyl	1	
9-40	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CONMe2	1	
9-41	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2Me	1	
9-42	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COSMe	1	
9-43	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
9-44	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	2-pyridylCO	COCH3	1	
9-45	3,5-diBr	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-46	3-Cl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-47	3-CF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-48	3,5-diCF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-49	3,4,5-triCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-50	3,5-diMe-4-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	l	m.p.(°C)
9-51	3-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-52	3-CH3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-53	3-CH3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-54	3-CN	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-55	3-CF3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-56	3-CH3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-57	3-CH3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-58	3-CH3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-59	3-CF3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-60	3-CF3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-61	3-CF3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-62	3-OH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-63	3-SH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-64	3,5-diCl	CF3	Cl	CN	H	H	COCH3	1	
9-65	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	H	H	COCH3	1	
9-66	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	Me	H	COCH3	1	
9-67	3,5-diCl	CF3	Cl	cyclo-Pr	H	H	COCH3	1	
9-68	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3	H	H	COCH3	1	
9-69	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Me	H	H	COCH3	1	
9-70	3,5-diCl	CF3	Cl	CH=CH2	H	H	COCH3	1	
9-71	3,5-diCl	CF3	Cl	CH2CH2	H	H	COCH3	1	
9-72	3,5-diCl	CF3	Cl	CCH	H	H	COCH3	1	
9-73	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COEt	1	
9-74	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-n	1	
9-75	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-iso	1	
9-76	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COBu-tert	1	
9-77	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCF3	1	
9-78	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh	1	
9-79	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridyl-2	1	
9-80	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridyl-3	1	
9-81	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridylCO-4	1	
9-82	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-2	1	
9-83	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-3	1	
9-84	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-4	1	
9-85	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-2	1	
9-86	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-3	1	
9-87	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-4	1	
9-88	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Br-2	1	
9-89	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Me-2	1	
9-90	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	Covinyl	1	
9-91	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPropargyl	1	
9-92	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	MeSO2	1	
9-93	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CF3SO2	1	
9-94	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONHMe	1	
9-95	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONMe2	1	
9-96	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2Me	1	
9-97	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	C(O)SMe	1	
9-98	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CSMe	1	
9-99	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CON(Me)OMe	1	
9-100	3,5-diCl	CH3	Br	H	H	H	COCH3	1	
9-101	3,5-diCl	CH3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-102	3,5-diCl	CH3	CN	H	H	H	COCH3	1	
9-103	3,5-diCl	CH3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
9-104	3,5-diCl	CH3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	1	
9-105	3,5-diCl	CH3	NHCOCF3	H	H	H	COCH3	1	
9-106	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
9-107	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	1	
9-108	3,5-diCl	CH3	NHSO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
9-109	3,5-diCl	CH3	NHSO2CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-110	3,5-diCl	CH3	C=NOCH3	H	H	H	COCH3	1	
9-111	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	2	
9-112	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-113	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
9-114	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COPr-cyclo	1	
9-115	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-116	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
9-117	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COPr-cyclo	1	
9-118	3,4,-diCl, 5-CF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	

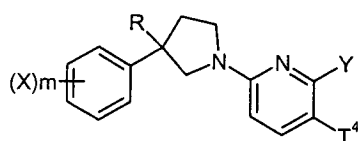
表 10



	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	m.p.(°C)
10-1	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-2	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	1	
10-3	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COC2H5	1	
10-4	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO(i-Pr)	1	
10-5	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2-pyridyl	1	
10-6	3,5-diCl	CF3	F	H	H	H	COCH3	1	
10-7	3,5-diCl	CF3	I	H	H	H	COCH3	1	
10-8	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	H	COCH3	1	
10-9	3,5-diCl	CF3	CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-10	3,5-diCl	CF3	MeS	H	H	H	COCH3	1	
10-11	3,5-diCl	CF3	MeSO	H	H	H	COCH3	1	
10-12	3,5-diCl	CF3	MeSO2	H	H	H	COCH3	1	
10-13	3,5-diCl	CF3	CF3S	H	H	H	COCH3	1	
10-14	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	H	H	H	COCH3	1	
10-15	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	H	H	H	COCH3	1	
10-16	3,5-diCl	CF3	OCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-17	3,5-diCl	CF3	OCF3	H	H	H	COCH3	1	
10-18	3,5-diCl	CF3	OH	H	H	H	COCH3	1	
10-19	3,5-diCl	CF3	SH	H	H	H	COCH3	1	
10-20	3,5-diCl	CF3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
10-21	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-22	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-23	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	1	
10-24	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	CO2-pyridyl	1	
10-25	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
10-26	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Et	COCH3	1	
10-27	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	vinyl	COCH3	1	
10-28	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	propargyl	COCH3	1	
10-29	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2Ph	COCH3	1	
10-30	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CN	COCH3	1	
10-31	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2CF3	COCH3	1	
10-32	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	cycloPr	COCH3	1	
10-33	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	COCH3	COCH3	1	
10-34	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2H5	1	
10-35	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2F5	1	
10-36	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COPh	1	
10-37	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2-pyridyl	1	
10-38	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CONMe2	1	
10-39	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2Me	1	
10-40	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COSMe	1	
10-41	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
10-42	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	2-pyridylCO	COCH3	1	
10-43	3,5-diBr	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-44	3-Cl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-45	3-CF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-46	3,5-diCF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-47	3,4,5-triCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-48	3,5-diMe-4-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-49	3-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	

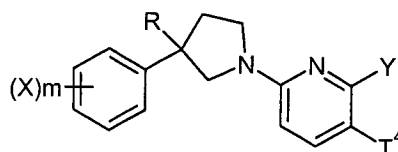
	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	l	m.p.(°C)
10-50	3-CH3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-51	3-CH3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-52	3-CN	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-53	3-CF3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-54	3-CH3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-55	3-CH3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-56	3-CH3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-57	3-CF3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-58	3-CF3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-59	3-CF3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-60	3-OH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-61	3-SH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-62	3,5-diCl	CF3	Cl	CN	H	H	COCH3	1	
10-63	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	H	H	COCH3	1	
10-64	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	Me	H	COCH3	1	
10-65	3,5-diCl	CF3	Cl	cyclo-Pr	H	H	COCH3	1	
10-66	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3	H	H	COCH3	1	
10-67	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Me	H	H	COCH3	1	
10-68	3,5-diCl	CF3	Cl	CH=CH2	H	H	COCH3	1	
10-69	3,5-diCl	CF3	Cl	CH2CH2	H	H	COCH3	1	
10-70	3,5-diCl	CF3	Cl	CCH	H	H	COCH3	1	
10-71	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COEt	1	
10-72	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-n	1	
10-73	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-iso	1	
10-74	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COBu-tert	1	
10-75	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCF3	1	
10-76	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh	1	
10-77	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridyl-2	1	
10-78	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridyl-3	1	
10-79	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPyridylCO-4	1	
10-80	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-2	1	
10-81	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-3	1	
10-82	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-4	1	
10-83	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-2	1	
10-84	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-3	1	
10-85	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-4	1	
10-86	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Br-2	1	
10-87	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Me-2	1	
10-88	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	Covinyl	1	
10-89	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	Copropargyl	1	
10-90	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	MeSO2	1	
10-91	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CF3SO2	1	
10-92	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONHMe	1	
10-93	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONMe2	1	
10-94	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2Me	1	
10-95	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	C(O)SMe	1	
10-96	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CSMe	1	
10-97	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CON(Me)OMe	1	
10-98	3,5-diCl	CH3	Br	H	H	H	COCH3	1	
10-99	3,5-diCl	CH3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-100	3,5-diCl	CH3	CN	H	H	H	COCH3	1	
10-101	3,5-diCl	CH3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
10-102	3,5-diCl	CH3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-103	3,5-diCl	CH3	NHCOCF3	H	H	H	COCH3	1	
10-104	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-105	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	1	
10-106	3,5-diCl	CH3	NHSO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-107	3,5-diCl	CH3	NHSO2CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-108	3,5-diCl	CH3	C=NOCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-109	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	2	
10-110	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-111	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
10-112	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COPr-cyclo	1	
10-113	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-114	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
10-115	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COPr-cyclo	1	
10-116	3,4,-diCl, 5-CF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	

表 11



	(X)m	R	Y	T ⁴	m.p. (°C)
11-1	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-2	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-3	3,5-diCl	CF ₃	NH ₂	CO ₂ Me	
11-4	3,5-diCl	CF ₃	F	CO ₂ Me	
11-5	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Me	
11-6	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Bu-t	
11-7	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ H	
11-8	3,5-diCl	CF ₃	Br	CO ₂ Me	
11-9	3,5-diCl	CF ₃	I	CO ₂ Me	
11-10	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	CO ₂ Me	
11-11	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CH ₃	
11-12	3,5-diCl	CF ₃	CN	F	
11-13	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NO ₂	
11-14	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NH ₂	
11-15	3,5-diCl	CF ₃	Br	NO ₂	
11-16	3,5-diCl	CF ₃	Br	NH ₂	
11-17	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-18	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-19	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-20	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-21	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-22	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-23	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-24	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-25	3,5-diBr	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-26	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-27	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-28	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-29	3-CH ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-30	3-CH ₃ O	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-31	3-CN	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-32	3-CF ₃ O	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-33	3-CH ₃ S	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-34	3-CH ₃ S(O)	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-35	3-CH ₃ S(O) ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-36	3-CF ₃ S	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-37	3-CF ₃ S(O)	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-38	3-CF ₃ S(O) ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-39	3-OH	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-40	3-SH	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-41	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-42	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-43	2-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-44	2-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-45	4-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-46	4-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-47	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ Et	
11-48	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ H	
11-49	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-50	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-51	3,5-diCl	CF ₃	CN	CO ₂ H	
11-52	3,5-diCl	CF ₃	CN	CO ₂ Me	
11-53	3,5-diCF ₃	CF ₃	CF ₃	CO ₂ Et	
11-54	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	F	
11-55	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	NO ₂	
11-56	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	NH ₂	
11-57	3,5-diCl	CF ₃	F	CO ₂ Et	
11-58	3,4,5-triCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ Et	
11-59	3,4,5-triCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ H	

表 12



	(X)m	R	Y	T ⁴	m.p. (°C)
12-1	3,5-diCl	CF ₃	H	NO ₂	
12-2	3,5-diCl	CF ₃	H	CN	
12-3	3,5-diCl	CF ₃	H	NH ₂	
12-4	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ Me	
12-5	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ H	
12-6	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-7	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-8	3,5-diCl	CF ₃	NH ₂	CO ₂ Me	
12-9	3,5-diCl	CF ₃	F	CO ₂ Me	
12-10	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Me	
12-11	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Bu-t	
12-12	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ H	
12-13	3,5-diCl	CF ₃	Br	CO ₂ Me	
12-14	3,5-diCl	CF ₃	I	CO ₂ Me	
12-15	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	CO ₂ Me	
12-16	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CH ₃	
12-17	3,5-diCl	CF ₃	CN	F	
12-18	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NO ₂	
12-19	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NH ₂	
12-20	3,5-diCl	CF ₃	Br	NO ₂	
12-21	3,5-diCl	CF ₃	Br	NH ₂	
12-22	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-23	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-24	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-25	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-26	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-27	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-28	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-29	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-30	3,5-diBr	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-31	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-32	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-33	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-34	3-CH ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-35	3-CH ₃ O	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-36	3-CN	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-37	3-CF ₃ O	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-38	3-CH ₃ S	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-39	3-CH ₃ S(O)	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-40	3-CH ₃ S(O) ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	

	(X)m	R	Y	T ⁴	m.p. (°C)
12-41	3-CF ₃ S	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-42	3-CF ₃ S(O)	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-43	3-CF ₃ S(O) ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-44	3-OH	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-45	3-SH	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-46	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-47	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-48	2-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-49	2-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-50	4-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-51	4-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-52	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ Et	
12-53	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ H	
12-54	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-55	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-56	3,5-diCl	CF ₃	CN	CO ₂ H	
12-57	3,5-diCl	CF ₃	CN	CO ₂ Me	
12-58	3,5-diCF ₃	CF ₃	CF ₃	CO ₂ Et	
12-59	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	F	
12-60	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	NO ₂	
12-61	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	NH ₂	
12-62	3,5-diCl	CF ₃	F	CO ₂ Et	
12-63	3,4,5-triCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ Et	
12-64	3,4,5-triCl	CF ₃	CF ₃	CO ₂ H	

表 13

	1H-NMR
1-2	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.50-2.60 (1H, m), 2.83-2.91 (1H, m), 3.49-3.65 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.12 (1H, d), 4.75 (2H, d), 6.61 (2H, d), 7.21 (1H, dd), 7.29 (2H, d), 7.33-7.40 (3H, m), 7.68 (1H, td), 7.82 (2H, d), 8.57 (1H, d).
1-3	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.51-2.56 (4H, m), 2.83-2.87 (1H, m), 3.50-3.56 (2H, m), 3.78 (1H, d), 4.00-4.15 (3H, m), 6.03 (1H, br s), 6.38-6.41 (2H, m), 7.26-7.39 (4H, m).
1-4	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.49-2.55 (4H, m), 2.80-2.88 (1H, m), 3.50-3.56 (2H, m), 3.78 (1H, d), 4.08 (1H, d), 4.71 (2H, d), 6.39-6.41 (2H, m), 7.10-7.18 (2H, m), 7.32-7.43 (4H, m), 7.65-7.68 (1H, m), 8.51 (1H, d).
1-6	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.50-2.63 (1H, m), 2.86-2.90 (1H, m), 3.53-3.58 (2H, m), 3.78-3.81 (1H, m), 4.10-4.14 (1H, m), 4.78 (2H, d), 6.23-6.28 (1H, m), 6.43-6.46 (1H, m), 7.17-7.40 (5H, m), 7.67-7.77 (2H, m), 8.02-8.06 (1H, m), 8.57-8.59 (1H, m).
1-7	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.55-2.57 (1H, m), 2.87-2.88 (1H, m), 3.51-3.61 (2H, m), 3.80 (1H, d), 4.08-4.19 (3H, m), 6.53-6.56 (2H, m), 6.87-6.91 (1H, m), 7.26-7.27 (1H, m), 7.39-7.42 (1H, m), 7.85-7.88 (1H, m).
1-8	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.53-2.60 (1H, m), 2.86-2.90 (1H, m), 3.53-3.56 (2H, m), 3.79 (1H, d), 4.09 (1H, d), 4.80 (2H, d), 6.52-6.56 (2H, m), 7.20-7.27 (2H, m), 7.38-7.39 (2H, m), 7.70-7.73 (2H, m), 7.85 (1H, d), 8.56 (1H, d).
1-9	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.56-2.58 (1H, m), 2.85-2.93 (1H, m), 3.51-3.58 (2H, m), 3.78 (1H, d), 4.10-4.14 (3H, m), 6.56-6.61 (2H, m), 6.75-6.76 (1H, m), 7.26-7.29 (1H, m), 7.40-7.40 (1H, m), 7.69 (1H, d).
1-10	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.53-2.60 (1H, m), 2.85-2.90 (1H, m), 3.46-3.59 (2H, m), 3.78 (1H, d), 4.08 (1H, d), 4.77 (2H, d), 6.55-6.56 (1H, m), 6.75-6.78 (1H, m), 7.18-7.44 (5H, m), 7.65-7.70 (2H, m), 8.54-8.55 (1H, m).
1-11	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 0.62-0.65 (2H, m), 0.83-0.89 (2H, m), 2.54-2.61 (1H, m), 2.86-2.90 (2H, m), 3.47-3.57 (2H, m), 3.76 (1H, d), 4.06 (1H, d), 6.34 (1H, br s), 6.52-6.55 (1H, m), 6.71 (1H, d), 7.26-7.27 (2H, m), 7.39-7.40 (1H, m), 7.63 (1H, d).
1-12	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.55-2.60 (1H, m), 2.74 (2H, t, $J = 6.3$ Hz), 2.86-2.90 (1H, m), 3.50-3.57 (2H, m), 3.67-3.79 (3H, m), 4.08 (1H, d), 6.53-6.56 (1H, m), 6.74-6.81 (2H, m), 7.27-7.27 (1H, m), 7.40-7.40 (1H, m), 7.63 (1H, dz).
1-15	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.56-2.66 (1H, m), 2.90-2.98 (1H, m), 3.52-3.68 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.04-4.16 (3H, m), 6.09 (1H, t), 6.75 (1H, dd), 7.10 (1H, d), 7.28 (2H, d), 7.40-7.43 (2H, m).
1-16	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.54-2.65 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.51-3.67 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.13 (1H, d), 4.74 (2H, d), 6.75 (1H, dd), 7.08 (1H, d), 7.15-7.23 (2H, m), 7.28 (2H, br s), 7.37 (1H, d), 7.41 (1H, t), 7.49 (1H, d), 7.70 (1H, td), 8.52 (1H, d).
1-17	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.57-2.67 (1H, m), 2.88-2.98 (1H, m), 3.49-3.67 (2H, m), 3.87 (1H, d), 4.15 (1H, d), 4.75 (2H, d), 6.74 (1H, dd), 7.08 (1H, d), 7.14 (1H, t), 7.21 (1H, dd), 7.26-7.38 (5H, m), 7.49 (1H, d), 7.70 (1H, td), 8.52 (1H, d).
1-18	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.58-2.68 (1H, m), 2.91-3.00 (1H, m), 3.50-3.68 (2H, m), 3.87 (1H, d), 4.04-4.17 (3H, m), 6.06 (1H, t), 6.75 (1H, d), 7.10 (1H, s), 7.26-7.42 (5H, m).
1-21	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.61-2.72 (1H, m), 2.98-3.06 (1H, m), 3.53-3.70 (2H, m), 3.90 (1H, d), 4.09 (2H, dt), 4.22 (1H, d), 6.08 (1H, t), 6.76 (1H, dd), 7.11 (1H, d), 7.42 (1H, d), 7.57-7.69 (4H, m).
1-22	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.62-2.73 (1H, m), 3.03-3.11 (1H, m), 3.57-3.73 (2H, m), 3.89 (1H, d), 4.27 (1H, d), 4.75 (2H, d), 6.79 (1H, dd), 7.12 (1H, d), 7.16-7.24 (2H, m), 7.37 (1H, d), 7.51 (1H, d), 7.70 (1H, td), 7.84 (2H, br s), 7.95 (1H, br s), 8.52 (1H, d).
1-23	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.63-2.73 (1H, m), 3.04-3.13 (1H, m), 3.58-3.74 (2H, m), 3.89 (1H, d), 4.10 (2H, td), 4.28 (1H, d), 6.07 (1H, t), 6.80 (1H, dd), 7.15 (1H, d), 7.43 (1H, d), 7.83 (2H, br s), 7.95 (1H, br s).
1-25	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.54-2.61 (1H, m), 2.86-2.94 (1H, m), 3.52-3.64 (2H, m), 3.81 (1H, d), 4.11 (1H, d), 4.72 (2H, d), 6.69-6.72 (1H, m), 6.82-6.83 (1H, m), 7.15-7.40 (5H, m), 7.50-7.53 (1H, m), 7.66-7.69 (1H, m), 8.50 (1H, d).
1-27	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.55-2.63 (1H, m), 2.90-2.94 (1H, m), 3.55-3.62 (2H, m), 3.81-3.87 (1H, m), 4.11-4.14 (1H, m), 4.78 (2H, d), 6.76-6.79 (1H, m), 6.87-6.88 (1H, m), 7.26-7.35 (5H, m), 7.57-7.60 (1H, m), 7.68-7.70 (1H, m), 7.79-7.82 (1H, m), 8.55-8.57 (1H, m).
1-31	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.53-2.63 (1H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.45 (3H, s), 3.56-3.68 (2H, m), 3.82-3.86 (1H, m), 4.14-4.17 (1H, m), 4.74 (2H, d, $J = 5.1$ Hz), 6.72-6.75 (1H, m), 7.18-7.21 (1H, m), 7.28-7.29 (4H, m), 7.36-7.41 (2H, m), 7.53-7.55 (1H, m), 7.67-7.
1-38	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.46-2.56 (1H, m), 2.78-2.87 (1H, m), 3.49-3.57 (2H, m), 3.77 (1H, d), 4.06 (1H, d), 4.70 (2H, d), 5.79 (2H, d), 5.97-6.00 (1H, m), 7.18-7.41 (7H, m), 7.65-7.68 (1H, m), 8.56 (1H, d).
1-39	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.53-2.61 (1H, m), 2.84-2.92 (1H, m), 3.55-3.67 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.15 (1H, d), 4.72 (2H, d), 6.36-6.39 (1H, m), 7.25-7.36 (4H, m), 7.64-7.70 (2H, m), 7.92-7.95 (2H, m), 8.57 (1H, d), 13.64 (1H, s).
1-54	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.55-2.64 (1H, m), 2.89-2.94 (1H, m), 3.49-3.66 (2H, m), 3.84 (1H, d), 4.13 (1H, d), 4.74 (2H, d), 6.74 (1H, dd), 7.07 (1H, d), 7.16-7.27 (3H, m), 7.36 (1H, d), 7.47-7.52 (3H, m), 7.70 (1H, td), 8.51 (1H, d).
1-56	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.55-2.62 (1H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.52-3.67 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.12 (1H, d), 4.74 (2H, d), 6.75 (1H, dd), 7.08 (1H, d), 7.21 (2H, t), 7.36 (1H, d), 7.42 (2H, s), 7.49 (1H, d), 7.70 (1H, td), 8.51 (1H, d).
1-57	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.54-2.66 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.53-3.69 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.03-4.15 (3H, m), 6.08 (1H, br s), 6.75 (1H, dd), 7.10 (1H, s), 7.40-7.42 (3H, m).
1-60	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.36 (6H, s), 2.56-2.66 (1H, m), 2.91-2.99 (1H, m), 3.51-3.67 (2H, m), 3.85 (1H, d), 4.15 (1H, d), 4.74 (2H, d, $J = 4.9$ Hz), 6.75 (1H, dd), 7.09 (1H, d), 7.15-7.23 (4H, m), 7.37 (1H, d), 7.49 (1H, d), 7.70 (1H, td), 8.51 (1H, d).
1-61	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.37 (6H, s), 2.57-2.68 (1H, m), 2.92-3.00 (1H, m), 3.52-3.68 (2H, m), 3.86 (1H, d), 4.03-4.18 (3H, m), 6.09 (1H, t), 6.75 (1H, dd), 7.11 (1H, d), 7.15 (2H, s), 7.41 (1H, d).
1-63	1H-NMR (acetone-d ₆) δ : 2.72-2.85 (1H, m), 3.03-3.07 (1H, m), 3.63-3.71 (2H, m), 4.04 (1H), 4.38 (1H, d), 6.58 (1H, br s), 6.85-6.88 (1H, m), 7.02 (1H, d), 7.23 (1H, br s), 7.53-7.59 (4H, m).

	1H-NMR
1-73	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.09 (1H, s), 2.58-2.62 (1H, m), 2.90-2.94 (1H, m), 3.57-3.61 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.13 (1H), 4.22 (2H, q), 6.04 (1H, br s), 6.73-6.75 (1H, m), 7.07 (1H, d), 7.27-7.28 (2H, m), 7.41-7.43 (2H, m).
1-74	1H-NMR (acetone-d ₆) δ : 2.77-2.85 (1H, m), 3.08-3.10 (1H, m), 3.66-3.68 (2H, m), 4.09 (1H, d), 4.33-4.46 (3H, m), 6.94-6.97 (1H, m), 7.14 (1H, d), 7.55-7.63 (3H, m), 8.20-8.23 (1H, m).
1-75	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.50 (6H, s), 2.17 (3H, s), 2.57-2.62 (1H, m), 2.90-2.94 (1H, m), 3.02 (2H, s), 3.56-3.59 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.11 (1H, d), 5.82 (1H, br s), 6.71-6.73 (1H, m), 7.05 (1H, d), 7.27-7.28 (2H, m), 7.41-7.42 (2H, m).
1-78	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.54-2.64 (1H, m), 2.87-2.95 (1H, m), 3.53-3.69 (2H, m), 3.85 (1H, d), 4.15 (1H, d), 4.79 (2H, d), 6.95 (1H, dd), 7.17-7.21 (1H, m), 7.28 (2H, s), 7.35 (1H, d), 7.41 (1H, t), 7.65 (1H, td), 7.96 (1H, d), 8.10 (1H, d), 8.66-8.58 (2H, m).
1-80	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.64-2.75 (1H, m), 3.02-3.10 (1H, m), 3.54-3.73 (2H, m), 3.93 (1H, d), 4.04-4.15 (2H, m), 4.25 (1H, d), 6.04 (1H, t), 6.78 (1H, dd), 7.13 (1H, d), 7.43 (1H, d), 7.65 (1H, t), 7.76 (1H, d), 8.27-8.31 (2H, m).
1-81	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.51-2.61 (1H, m), 2.84-2.92 (1H, m), 3.45-3.61 (2H, m), 3.79 (1H, d), 4.08 (1H, d), 5.08 (2H, d), 6.49-6.54 (2H, m), 7.22-7.28 (3H, m), 7.36 (1H, d), 7.40 (1H, t), 7.72 (1H, td), 7.79 (1H, d), 8.54 (1H, d), 9.27 (1H, br s).
1-82	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.65-2.77 (1H, m), 3.18-3.26 (1H, m), 3.59 (2H, d), 3.99 (1H, d), 4.48 (1H, d), 4.75 (2H, d), 6.76 (1H, dd), 7.08-7.51 (9H, m), 7.70 (1H, td), 8.53 (1H, d).
1-83	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.65-2.76 (1H, m), 3.18-3.25 (1H, m), 3.59 (2H, d), 3.99 (1H, d), 4.49 (1H, d), 4.74 (2H, d), 6.76 (1H, dd), 7.07-7.38 (6H, m), 7.53 (2H, dt), 7.70 (1H, td), 8.52 (1H, d).
1-84	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.61-2.64 (1H, m), 2.89-2.93 (1H, m), 3.57-3.60 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.12 (1H, d), 4.62 (2H, d), 6.42 (1H, br s), 6.71-6.74 (1H, m), 7.06 (1H, d), 7.27-7.42 (5H, m), 7.79 (1H, d), 8.51-8.54 (2H, m).
1-85	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.57-2.63 (1H, m), 2.88-2.94 (1H, m), 3.54-3.63 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.13 (1H, d), 4.59 (2H, d), 6.64-6.74 (2H, m), 7.05 (1H, d), 7.28 (4H, d), 7.41-7.43 (2H, m), 8.51-8.53 (2H, m).
1-86	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.55-2.65 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.56-3.68 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.14 (1H, d), 4.72 (2H, d), 6.74-6.79 (2H, m), 7.09-7.10 (1H, m), 7.25-7.50 (5H, m), 7.68 (1H, t).
1-87	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.57-2.65 (1H, m), 2.90-2.95 (1H, m), 3.50-3.62 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.12 (1H, d), 4.53 (2H, d), 6.66-6.70 (2H, m), 7.02 (1H, d), 7.25-7.41 (5H, m), 7.72-7.74 (1H, m), 8.26 (1H, d).
1-88	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.58-2.63 (1H, m), 2.91-2.95 (1H, m), 3.53-3.68 (2H, m), 3.84 (1H, d), 4.14 (1H, d), 4.88 (2H, d), 6.75-6.78 (1H, m), 7.08 (1H, d), 7.20-7.29 (4H, m), 7.41-7.41 (1H, m), 7.55 (1H, d), 8.72 (2H, d).
1-90	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.56-2.61 (1H, m), 2.87-2.95 (1H, m), 3.53-3.65 (2H, m), 3.81 (1H, d), 3.99-4.13 (3H, m), 6.20-6.22 (1H, m), 6.68-6.71 (1H, m), 6.81 (1H, d), 7.27-7.28 (2H, m), 7.40-7.41 (1H, m), 7.45 (1H, d).
1-91	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.55-2.60 (1H, m), 2.88-2.92 (1H, m), 3.52-3.65 (2H, m), 3.81 (1H, d), 4.11 (1H, d), 4.67 (2H, d), 6.74-6.82 (3H, m), 7.23-7.28 (4H, m), 7.38-7.39 (1H, m), 7.50 (1H, d), 7.64 (1H, t).
1-92	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.55-2.62 (1H, m), 2.86-2.94 (1H, m), 3.12 (6H, d), 3.53-3.63 (2H, m), 3.82 (1H, d), 4.13 (1H, d), 6.62-6.67 (2H, m), 7.25-7.28 (1H, m), 7.40 (1H, d), 8.04 (1H, d), 8.54 (1H, s).
1-93	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.28 (3H, t), 2.59-2.64 (1H, m), 2.93-2.97 (1H, m), 3.58-3.67 (2H, m), 3.85 (1H, d), 4.10-4.18 (3H, m), 6.75-6.78 (1H, m), 7.09-7.50 (4H, m), 7.70-7.72 (1H, m), 8.47-8.50 (1H, m).
1-95	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.55-2.65 (1H, m), 2.88-2.97 (1H, m), 3.47-3.65 (2H, m), 3.86 (1H, d), 4.14 (1H, d), 4.73 (2H, d), 6.73 (1H, dd), 7.06 (1H, d), 7.23-7.15 (2H, m), 7.31-7.41 (5H, m), 7.48 (1H, d), 7.70 (1H, td), 8.51 (1H, d).
1-96	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.56-2.67 (1H, m), 2.90-2.99 (1H, m), 3.48-3.67 (2H, m), 3.86 (1H, d), 4.03-4.16 (3H, m), 6.06 (1H, br s), 6.73 (1H, dd), 7.09 (1H, d), 7.33 (2H, d), 7.38-7.42 (3H, m).
1-97	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.58-2.63 (1H, m), 2.91-2.96 (1H, m), 3.55-3.67 (2H, m), 3.81-3.84 (1H, m), 4.07-4.18 (3H, m), 6.70-6.80 (3H, m), 7.27-7.42 (3H, m), 7.75-7.78 (1H, m).
1-98	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.53-2.63 (1H, m), 2.89-2.92 (1H, m), 3.21-3.35 (1H, m), 3.59-3.78 (3H, m), 4.10-4.13 (1H, m), 5.94-5.97 (2H, m), 6.73-6.85 (2H, m), 7.23-7.56 (4H, m).
1-99	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.63-2.68 (1H, m), 3.02-3.07 (1H, m), 3.55-3.71 (2H, m), 3.86-3.90 (1H, m), 4.23-4.26 (1H, m), 4.74 (2H, d), 6.74-6.77 (1H, m), 6.86-6.86 (1H, m), 7.07-7.10 (1H, m), 7.20-7.22 (1H, m), 7.31-7.34 (1H, m), 7.53-7.56 (1H, m), 7.68-7.70 (1H, m).
1-100	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.65-2.67 (1H, m), 3.02-3.10 (1H, m), 3.59-3.66 (2H, m), 3.86-3.90 (1H, m), 4.11-4.20 (3H, m), 5.99-6.02 (1H, m), 6.76-6.85 (2H, m), 7.50-7.53 (1H, m), 7.84-7.95 (3H, m).
1-101	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.54-2.64 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.54-3.70 (2H, m), 3.85 (1H, d), 4.04-4.18 (3H, m), 6.94 (1H, dd), 7.29 (2H, s), 7.41 (1H, t), 7.92 (1H, d), 8.14-8.06 (2H, m).
1-102	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.46-2.61 (1H, m), 2.83-2.91 (1H, m), 3.50-3.60 (2H, m), 3.77-3.81 (1H, m), 4.07-4.10 (1H, m), 4.70 (2H, d, J = 4.9 Hz), 6.67-6.70 (1H, m), 6.80-6.81 (1H, m), 7.15-7.17 (2H, m), 7.30-7.32 (1H, m), 7.40-7.43 (2H, m), 7.48-7.51 (1H, m), 7.
2-8	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.54-2.65 (1H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.50-3.68 (2H, m), 3.84 (1H, d), 4.13 (1H, d), 6.71 (2H, d), 7.30 (2H, d), 7.41 (1H, t), 7.54 (2H, d), 8.85 (1H, s).
2-29	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.14 (3H, s), 2.54-2.64 (1H, m), 2.87-2.95 (1H, m), 3.49-3.65 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.12 (1H, d), 6.51-6.54 (2H, m), 7.17 (1H, d), 7.30 (2H, d), 7.41 (1H, t), 8.68 (1H, s).
2-31	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.59-2.69 (1H, m), 2.92-3.01 (1H, m), 3.57-3.73 (2H, m), 3.88 (1H, d), 4.18 (1H, d), 6.83 (1H, dd), 6.94 (1H, d), 7.44-7.30 (4H, m), 8.73 (1H, s).
2-40	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ : 2.62-2.73 (1H, m), 2.95-3.03 (1H, m), 3.49-3.55 (2H, m), 3.90 (1H, d), 4.31 (1H, d), 7.09 (1H, dd), 7.29 (1H, d), 7.61 (1H, d), 7.68 (2H, d), 7.71 (1H, t), 8.26 (1H, s), 8.98 (1H, s).

	1H-NMR
3-3	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.99 (3H, s), 2.50-2.58 (1H, m), 2.82-2.87 (1H, m), 3.45-3.51 (2H, m), 3.74 (1H, d), 4.02 (1H, d), 4.41 (2H, d), 6.43-6.46 (1H, m), 6.58 (1H, d), 7.26-7.38 (4H, m).
3-4	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.98-2.02 (3H, m), 2.53-2.61 (1H, m), 2.81-2.89 (1H, m), 3.46-3.52 (2H, m), 3.74 (1H, d), 4.02 (1H), 4.42-4.44 (2H, m), 5.78-5.81 (1H, m), 6.49-6.51 (1H, m), 6.77 (1H, d), 7.27-7.29 (4H, m).
3-11	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.13-2.18 (3H, m), 2.51-2.53 (1H, m), 2.81-2.83 (1H, m), 3.45-3.56 (2H, m), 3.75-3.78 (1H, m), 4.01-4.04 (1H, m), 4.25 (1H, s), 4.57 (1H, s), 6.40-6.44 (2H, m), 6.93-6.96 (1H, m), 7.30-7.38 (3H, m).
3-102	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.03 (3H, s), 2.53-2.60 (1H, m), 2.83-2.91 (1H, m), 3.51-3.59 (2H, m), 3.78-3.82 (1H, m), 4.07-4.13 (1H, m), 4.50-4.55 (2H, m), 5.72-5.76 (1H, m), 6.70-6.78 (2H, m), 7.27-7.53 (4H, m).
3-113	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.99 (3H, s), 2.58-2.68 (1H, m), 2.99-3.03 (1H, m), 3.51-3.67 (2H, m), 3.83-3.86 (1H, m), 4.18-4.21 (1H, m), 4.50 (2H, d), 5.73-5.76 (1H, m), 6.74-6.81 (2H, m), 7.47-7.50 (1H, m), 7.85-7.93 (3H, m).
4-1	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.56-2.64 (1H, m), 2.89-2.98 (1H, m), 3.63-3.67 (2H, m), 3.87 (1H, d), 4.19 (1H, d), 6.57 (2H, d), 7.27 (2H, br s), 7.42 (1H, t), 8.18 (2H, d).
4-2	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.51-2.62 (1H, m), 2.86-2.94 (1H, m), 3.56-3.61 (2H, m), 3.80 (1H, d), 4.12 (1H, d), 6.59 (2H, d), 7.26 (2H, br s), 7.41 (1H, t), 7.52 (2H, d).
4-3	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.45-2.54 (1H, m), 2.74-2.82 (1H, m), 3.34-3.47 (4H, m), 3.73 (1H, d), 3.93 (1H, d), 6.49-6.51 (2H, m), 6.67-6.71 (2H, m), 7.30 (2H, br s), 7.36 (1H, t).
4-5	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ : 2.58-2.72 (1H, m), 2.88-3.01 (1H, m), 3.41-3.53 (2H, m), 3.85 (1H, d), 4.26 (1H, d), 6.71 (2H, d), 7.65-7.72 (3H, m), 7.78 (2H, d), 12.25 (1H, br s).
4-6	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.53-2.67 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.50-3.71 (2H, m), 3.83 (1H, d), 3.85 (3H, s), 4.15 (1H, d), 6.69 (1H, dd), 6.75 (1H, d), 7.26 (3H, s), 7.42 (1H, t), 7.81 (1H, d).
4-7	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ : 2.58-2.72 (1H, m), 2.91-3.04 (1H, m), 3.47-3.57 (2H, m), 3.87 (1H, d), 4.32 (1H, d), 6.86 (1H, dd), 7.04 (1H, d), 7.65 (2H, d), 7.71 (1H, t), 7.78 (1H, d).
4-8	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.46-2.56 (1H, m), 2.79-2.85 (1H, m), 3.52-3.57 (2H, m), 3.76-3.86 (4H, m), 4.01-4.12 (1H, m), 5.68-5.76 (2H, m), 5.87-5.99 (1H, m), 6.26-6.32 (2H, m), 7.38-7.41 (1H, m), 7.75-7.76 (1H, m), 7.83-7.86 (1H, m).
4-10	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.53-2.58 (1H, m), 2.86-2.92 (1H, m), 3.52-3.62 (2H, m), 3.80 (1H, d), 3.87 (3H, s), 4.11 (1H, d), 6.45-6.48 (1H, m), 6.61 (1H, d), 7.26-7.27 (2H, m), 7.40-7.41 (1H, m), 7.88 (1H, d).
4-11	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.59 (9H, s), 2.54-2.56 (1H, m), 2.84-2.92 (1H, m), 3.53-3.56 (2H, m), 3.79 (1H, d), 4.09 (1H, d), 6.43-6.46 (1H, m), 6.58 (1H, d), 7.24-7.26 (2H, m), 7.40-7.40 (1H, m), 7.80 (1H, d).
4-12	1H-NMR (acetone-d ₆) δ : 2.74-2.84 (1H, m), 3.05-3.10 (1H, m), 3.64-3.69 (2H, m), 4.04 (1H, d), 4.40 (1H, d), 6.70-6.77 (2H, m), 7.55-7.65 (3H, m), 7.91 (1H, d).
4-13	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.53-2.60 (1H, m), 2.84-2.93 (1H, m), 3.52-3.62 (2H, m), 3.80-3.87 (4H, m), 4.11 (1H, d), 6.49-6.52 (1H, m), 6.84 (1H, d), 7.26-7.27 (2H, m), 7.40-7.41 (1H, m), 7.87 (1H, d).
4-14	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.51-2.56 (1H, m), 2.85-2.86 (1H, m), 3.51-3.57 (2H, m), 3.74-3.87 (4H, m), 4.09 (1H, d), 6.54-6.56 (1H, m), 7.17-7.18 (1H, m), 7.27-7.31 (2H, m), 7.38-7.39 (1H, m), 7.85 (1H, d).
4-15	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.53-2.60 (4H, m), 2.84-2.85 (1H, m), 3.52-3.62 (2H, m), 3.79-3.84 (4H, m), 4.11 (1H, d), 6.39-6.44 (2H, m), 7.26-7.29 (2H, m), 7.39-7.39 (1H, m), 7.91-7.94 (1H, m).
4-16	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.27 (3H, s), 2.49-2.54 (1H, m), 2.78-2.87 (1H, m), 3.38-3.54 (2H, m), 3.74 (1H, d, J = 10.4 Hz), 3.99 (1H, d, J = 10.4 Hz), 6.40-6.43 (1H, m), 6.60-6.62 (1H, m), 7.05-7.08 (1H, m), 7.21-7.33 (2H, m), 7.37-7.44 (1H, m).
4-18	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.51-2.64 (1H, m), 2.67 (3H, s), 2.87-2.95 (1H, m), 3.51-3.71 (2H, m), 3.84 (1H, d), 4.17 (1H, d), 6.37 (1H, d), 6.45 (1H, dd), 7.28 (2H, br s), 7.41 (1H, t), 8.14 (1H, d).
4-19	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.19 (3H, s), 2.41-2.58 (1H, m), 2.73-2.81 (1H, m), 3.15-3.51 (4H, m), 3.73 (1H, d), 3.92 (1H, d), 6.34-6.44 (2H, m), 6.66 (1H, d), 7.31-7.41 (3H, m).
4-20	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.53-2.66 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.51-3.71 (2H, m), 3.83 (1H, d), 4.16 (1H, d), 6.53 (1H, dd), 6.84 (1H, d), 7.27 (2H, br s), 7.42 (1H, t), 8.07 (1H, d).
4-21	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.44-2.54 (1H, m), 2.75-2.83 (1H, m), 3.32-3.50 (2H, m), 3.56-3.76 (3H, m), 3.92 (1H, d), 6.46 (1H, dd), 6.70-6.78 (2H, m), 7.29 (2H, br s), 7.37 (1H, t).
4-23	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ : 2.63-2.75 (1H, m), 2.96-3.12 (1H, m), 3.49-3.59 (2H, m), 3.91 (1H, d), 4.41 (1H, d), 6.88 (1H, dd), 7.06 (1H, d), 7.67-7.90 (5H, m), 13.00 (1H, br s).
4-24	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.61-2.73 (1H, m), 3.03-3.13 (1H, m), 3.58-3.75 (2H, m), 3.85 (3H, s), 3.89 (1H, d), 4.29 (1H, d), 6.73 (1H, dd), 6.79 (1H, d), 7.80-7.85 (3H, m), 7.95 (1H, br s).
4-25	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ : 2.66-2.80 (1H, m), 3.11-3.22 (1H, m), 3.51-3.61 (2H, m), 3.93 (1H, d), 4.51 (1H, d), 6.90 (1H, d), 7.06 (1H, br s), 7.81 (1H, t), 8.22 (3H, br s), 13.03 (1H, br s).
4-26	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.54-2.64 (1H, m), 2.89-2.97 (1H, m), 3.50-3.69 (2H, m), 3.84 (1H, d), 3.85 (3H, s), 4.15 (1H, d), 6.68 (1H, dd), 6.74 (1H, d), 7.22 (1H, dd), 7.47-7.52 (2H, m), 7.81 (1H, d).
4-27	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ : 2.59-2.74 (1H, m), 2.90-3.00 (1H, m), 3.49-3.57 (2H, m), 3.90 (1H, d), 4.30 (1H, d), 6.86 (1H, dd), 7.03 (1H, d), 7.55 (1H, d), 7.73-7.86 (3H, m), 12.98 (1H, br s).
4-29	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ : 2.59-2.71 (1H, m), 2.90-3.01 (1H, m), 3.49-3.57 (2H, m), 3.89 (1H, d), 4.31 (1H, d), 6.87 (1H, dd), 7.05 (1H, d), 7.50 (3H, br s), 7.64 (1H, br s), 7.78 (1H, d), 13.00 (1H, br s).

	1H-NMR
4-32	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.36 (6H, s), 2.56-2.66 (1H, m), 2.92-3.00 (1H, m), 3.52-3.69 (2H, m), 3.93-3.84 (4H, m), 4.17 (1H, d), 6.69 (1H, dd), 6.75 (1H, d), 7.14 (2H, s), 7.81 (1H, d).
4-33	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.63-2.73 (1H, m), 3.01-3.09 (1H, m), 3.55-3.73 (2H, m), 3.85 (3H, s), 3.92 (1H, d), 4.26 (1H, d), 6.71 (1H, dd), 6.77 (1H, d), 7.62-7.83 (3H, m), 8.27-8.31 (2H, m).
4-47	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ : 2.66-2.77 (1H, m), 3.01-3.10 (1H, m), 3.50-3.62 (2H, m), 3.95 (1H, d), 4.43 (1H, d), 6.89 (1H, d), 7.08 (1H, s), 7.75-7.81 (2H, m), 8.03 (1H, d), 8.28-8.35 (2H, m), 13.02 (1H, br s).
4-48	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ : 2.60-2.72 (1H, m), 2.94-3.05 (1H, m), 3.50-3.57 (2H, m), 3.90 (1H, d), 4.32 (1H, d), 6.87 (1H, d), 7.03 (1H, s), 7.79 (1H, d, J = 9.0 Hz), 7.88 (2H, s), 13.03 (1H, s).
4-49	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.64-2.75 (1H, m), 3.18-3.25 (1H, m), 3.55-3.63 (2H, m), 3.84 (3H, s), 3.98 (1H, d), 4.50 (1H, d), 6.67-6.74 (2H, m), 7.32-7.48 (4H, m), 7.82 (1H, d).
4-50	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ : 2.67-2.78 (1H, m), 3.23-3.37 (1H, m), 3.46-3.64 (2H, m), 3.91 (1H, d), 4.57 (1H, d), 6.86 (1H, dd), 7.04 (1H, d), 7.43-7.56 (3H, m), 7.64-7.68 (1H, m), 7.80 (1H, d), 13.01 (1H, br s).
4-51	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.55-2.65 (1H, m), 2.89-2.98 (1H, m), 3.49-3.67 (2H, m), 3.84 (3H, s), 3.86 (1H, d), 4.14 (1H, t), 6.66 (1H, dd), 6.73 (1H, d), 7.32 (2H, d), 7.40 (2H, d), 7.80 (1H, d).
4-52	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ : 2.58-2.68 (1H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.45-3.60 (2H, m), 3.90 (1H, d), 4.28 (1H, d), 6.85 (1H, dd), 7.03 (1H, d), 7.52 (2H, d), 7.57 (2H, d), 7.78 (1H, d), 13.02 (1H, br s).
4-53	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.37 (3H, t), 2.56-2.61 (1H, m), 2.89-2.94 (1H, m), 3.58-3.66 (2H, m), 3.82-3.85 (1H, m), 4.12-4.16 (1H, m), 4.35 (2H, q), 6.67-6.70 (1H, m), 6.88-6.89 (1H, m), 7.25-7.28 (2H, m), 7.41-7.41 (1H, m), 7.86-7.89 (1H, m).
4-56	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.53-2.63 (1H, m), 2.88-2.97 (1H, m), 3.53-3.69 (2H, m), 3.82 (2H, d), 3.85 (3H, s), 4.14 (1H, d), 6.69 (1H, dd), 6.75 (1H, d), 7.41 (2H, s), 7.81 (1H, d).
4-57	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ : 2.64-2.67 (1H, m), 2.93-3.00 (1H, m), 3.49-3.52 (2H, m), 3.88-3.90 (1H, m), 4.31-4.35 (1H, m), 6.92-6.95 (1H, m), 7.18-7.21 (1H, m), 7.67-7.69 (3H, m), 7.89-7.92 (1H, m).
4-58	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.57-2.63 (1H, m), 2.91-2.96 (1H, m), 3.52-3.69 (2H, m), 3.82-3.86 (1H, m), 3.94 (3H, s), 4.11-4.18 (1H, m), 6.73-6.76 (1H, m), 6.89-6.90 (1H, m), 7.27-7.42 (3H, m), 8.01-8.03 (1H, m).
4-59	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.63 (9H, s), 2.53-2.63 (1H, m), 2.87-2.95 (1H, m), 3.53-3.69 (2H, m), 3.84 (1H, d), 4.13 (1H, d), 6.86 (1H, dd), 7.28 (2H, d), 7.41 (1H, t), 7.95 (1H, d), 8.10 (1H, d).
4-60	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.58-2.69 (1H, m), 2.93-3.02 (1H, m), 3.63-3.73 (2H, m), 3.93 (1H, d), 4.27 (1H, d), 7.18 (1H, d), 7.26 (1H, s), 7.30 (2H, s), 7.41 (1H, s), 8.13 (1H, d), 8.20 (1H, s), 9.92 (1H, s).
4-61	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.37 (3H, t), 2.60-2.71 (1H, m), 3.01-3.09 (1H, m), 3.60-3.71 (2H, m), 3.88-3.90 (1H, m), 4.28-4.36 (3H, m), 6.71-6.74 (1H, m), 6.91-6.91 (1H, m), 7.84-7.97 (4H, m).
4-62	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.51-2.61 (1H, m), 2.83-2.91 (1H, m), 3.43-3.58 (2H, m), 3.77 (1H, d), 4.03 (1H, d), 6.71-6.66 (2H, m), 7.10 (1H, t), 7.29 (2H, s), 7.39 (1H, s).
4-63	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.57-2.68 (1H, m), 2.93-3.01 (1H, m), 3.75-3.59 (2H, m), 3.87 (1H, d), 4.20 (1H, d), 6.70 (1H, dd), 6.88 (1H, d), 7.28 (2H, d), 7.43 (1H, t), 8.08 (1H, d).
4-65	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.37 (3H, t), 2.53-2.58 (1H, m), 2.85-2.93 (1H, m), 3.53-3.62 (2H, m), 3.78-3.81 (1H, m), 4.08-4.16 (1H, m), 4.34 (2H, q), 6.25-6.36 (2H, m), 7.28-7.33 (3H, m), 7.84-7.87 (1H, m).
4-66	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.36 (3H, t), 2.55-2.62 (1H, m), 2.86-2.94 (1H, m), 3.57-3.63 (2H, m), 3.80-3.84 (1H, m), 4.12-4.15 (1H, m), 4.33 (2H, q), 6.67-6.70 (1H, m), 6.87-6.88 (1H, m), 7.41-7.45 (2H, m), 7.84-7.87 (1H, m).
5-1	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.50-2.68 (2H, m), 2.74-2.82 (1H, m), 2.90-2.98 (1H, m), 3.16-3.20 (1H, m), 3.61-3.75 (3H, m), 7.20-7.41 (9H, m).
5-2	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.45-2.55 (1H, m), 2.76-2.85 (1H, m), 3.00-3.09 (1H, m), 3.22-3.35 (2H, m), 4.10 (1H, d), 7.23-7.44 (4H, m).
5-3	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.33-2.42 (1H, m), 2.55-2.63 (1H, m), 2.74-2.78 (2H, m), 3.09 (1H, d), 3.18 (1H, d), 3.67 (2H, s), 7.26-7.38 (9H, m).
5-4	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.28-2.38 (1H, m), 2.49-2.59 (1H, m), 2.97-3.06 (1H, m), 3.19-3.30 (2H, m), 3.75 (1H, d), 7.28-7.33 (4H, m).
5-5	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.31-2.41 (1H, m), 2.55-2.63 (1H, m), 2.70-2.81 (2H, m), 3.08 (1H, d), 3.18 (1H, d), 3.66 (2H, s), 7.24-7.33 (9H, m).
5-6	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.27-2.36 (1H, m), 2.49-2.59 (1H, m), 2.96-3.05 (1H, m), 3.20-3.29 (2H, m), 3.76 (1H, d), 7.28-7.36 (4H, m).
5-7	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.50-2.66 (2H, m), 2.76-2.84 (1H, m), 2.91-2.99 (1H, m), 3.16 (1H, dd), 3.61-3.75 (3H, m), 7.17 (1H, t), 7.25-7.35 (6H, m), 7.46 (1H, dd).
5-8	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.41-2.53 (1H, m), 2.78-2.87 (1H, m), 3.00-3.09 (1H, m), 3.23-3.32 (2H, m), 4.11 (1H, d), 7.18-7.30 (2H, m), 7.48 (1H, dd).
5-9	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.28-2.37 (1H, m), 2.54-2.62 (1H, m), 2.70-2.82 (2H, m), 3.06 (1H, d), 3.13 (1H, d), 3.66 (2H, s), 7.21-7.33 (6H, m), 7.41 (1H, d), 7.49 (1H, d).
5-10	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.25-2.34 (1H, m), 2.50-2.59 (1H, m), 2.97-3.08 (1H, m), 3.20-3.28 (2H, m), 3.75 (1H, d), 7.20 (1H, d), 7.44 (2H, d).

	1H-NMR
5-11	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.27-2.36 (1H, m), 2.53-2.62 (1H, m), 2.69-2.83 (2H, m), 3.08 (2H, dd), 3.67 (2H, s), 7.25-7.36 (8H, m).
5-12	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.24-2.33 (1H, m), 2.51-2.56 (1H, m), 2.97-3.07 (1H, m), 3.19-3.26 (2H, m), 3.74 (1H, d), 7.25 (2H, d), 7.35 (1H, t).
5-14	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.24-2.34 (1H, m), 2.53-2.61 (1H, m), 2.67-2.87 (2H, m), 3.06 (2H, dd), 3.67 (2H, dd), 7.24-7.43 (7H, m).
5-15	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.22-2.32 (1H, m), 2.49-2.58 (1H, m), 2.98-3.08 (1H, m), 3.20-3.29 (2H, m), 3.73 (1H, d), 7.39 (2H, s).
5-16	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.35-2.44 (1H, m), 2.60-2.68 (1H, m), 2.72-2.85 (2H, m), 3.16 (2H, dd), 3.68 (2H, dd), 7.28-7.34 (5H, m), 7.46 (1H, t), 7.55-7.60 (2H, m), 7.66 (1H, s).
5-17	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.32-2.41 (1H, m), 2.55-2.65 (1H, m), 2.98-3.07 (1H, m), 3.21-3.33 (2H, m), 3.82 (1H, d), 7.47-7.62 (4H, m).
5-18	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.29-2.40 (1H, m), 2.63-2.77 (2H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.09 (1H, d), 3.16 (1H, d), 3.62 (1H, d), 3.76 (1H, d, J = 13.0 Hz), 7.28-7.34 (5H, m), 7.83 (1H, s), 7.89 (2H, s).
5-19	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.30-2.39 (1H, m), 2.61-2.70 (1H, m), 3.02-3.10 (1H, m), 3.24-3.33 (2H, m), 3.86 (1H, d), 7.81 (2H, s), 7.87 (1H, s).
5-24	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.35-2.44 (1H, m), 2.63-2.90 (3H, m), 3.17 (2H, s), 3.69 (2H, dd), 7.26-7.34 (5H, m), 7.53 (1H, t), 7.74 (1H, d), 8.18 (1H, dq), 8.34 (1H, s).
5-25	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.34-2.43 (1H, m), 2.59-2.69 (1H, m), 3.01-3.10 (1H, m), 3.24-3.35 (2H, m), 3.85 (1H, d), 7.57 (1H, t), 7.72 (1H, d), 8.20-8.27 (2H, m).
5-26	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.31-2.42 (7H, m), 2.55-2.63 (1H, m), 2.75-2.80 (2H, m), 3.11 (2H, dd), 3.67 (2H, s), 7.14-7.34 (7H, m).
5-27	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.29-2.38 (7H, m), 2.51-2.60 (1H, m), 2.97-3.07 (1H, m), 3.21-3.31 (2H, m), 3.77 (1H, d), 7.12 (2H, s).
6-1	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.34 (6H, s), 5.78-5.80 (1H, m), 6.03-6.04 (1H, m), 7.20 (2H, s).
7-1	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.52-2.63 (1H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.60-3.77 (2H, m), 4.00 (1H, d), 4.18-4.07 (2H, m), 4.48 (1H, d), 6.16 (1H, t), 6.43 (1H, d), 7.30 (2H, d), 7.39 (1H, t), 7.95 (1H, dd), 8.62 (1H, d).
7-2	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.52-2.62 (1H, m), 2.87-2.96 (1H, m), 3.59-3.75 (2H, m), 4.01 (1H, d), 4.48 (1H, d), 4.75 (2H, d), 6.43 (1H, d), 7.25-7.20 (1H, m), 7.31 (2H, d), 7.39 (1H, t), 7.47 (1H, s), 7.69 (1H, td), 8.00-8.04 (1H, m), 8.56 (1H, d), 8.73 (1H, d).
7-3	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.49-2.57 (1H, m), 2.60 (3H, s), 2.84-2.92 (1H, m), 3.59-3.70 (2H, m), 3.95-4.15 (3H, m), 4.45 (1H, d), 5.94 (1H, br s), 6.23 (1H, d), 7.26-7.39 (4H, m), 7.58 (1H, d).
7-7	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.54-2.61 (1H, m), 2.89-2.94 (1H, m), 3.65-3.68 (2H, m), 3.94-3.98 (1H, m), 4.10-4.16 (2H, m), 4.45-4.48 (1H, m), 6.37-6.40 (1H, m), 7.23-7.38 (4H, m), 8.12-8.15 (1H, m).
7-25	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.54-2.61 (1H, m), 2.88-2.92 (1H, m), 3.64-3.70 (2H, m), 3.98 (1H, d), 4.44 (1H, d), 4.73 (2H, d), 6.54 (1H, d), 7.14-7.40 (6H, m), 7.69-7.74 (2H, m), 8.52 (1H, d).
7-26	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.53-2.63 (1H, m), 2.88-2.96 (1H, m), 3.68-3.71 (2H, m), 4.05-4.16 (3H, m), 4.45 (1H, d), 6.03 (1H, br s), 6.55 (1H, d), 7.24-7.37 (4H, m), 7.72 (1H, d).
8-23	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.55-2.65 (1H, m), 2.92-2.97 (1H, m), 3.69-3.77 (2H, m), 3.97-4.01 (1H, m), 4.47-4.51 (1H, m), 4.75 (2H, d), 6.62 (1H, s), 7.24-7.36 (6H, m), 7.68-7.70 (1H, m), 8.51-8.52 (2H, m).
8-24	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.58-2.63 (1H, m), 2.93-2.97 (1H, m), 3.71-3.74 (2H, m), 3.96-4.09 (3H, m), 4.47-4.51 (1H, m), 6.42-6.44 (1H, m), 6.61 (1H, s), 7.30 (2H, s), 7.40 (1H, s), 8.41 (1H, s).
8-25	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.55-2.65 (1H, m), 2.91-2.97 (1H, m), 3.68-3.73 (2H, m), 3.97-4.01 (1H, m), 4.48-4.52 (1H, m), 5.74-5.77 (2H, m), 6.62 (1H, s), 7.20-7.37 (3H, m), 8.52 (1H, s).
11-47	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 1.37 (3H, t, J = 7.1 Hz), 2.55-2.66 (1H, m), 2.91-2.99 (1H, m), 3.73-3.75 (2H, m), 4.00-4.04 (1H, m), 4.36 (2H, q, J = 7.1 Hz), 4.49-4.54 (1H, m), 6.65 (1H, s), 7.30 (2H, s), 7.40 (1H, s), 8.84 (1H, s).
12-4	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.52-2.62 (1H, m), 2.87-2.95 (1H, m), 3.61-3.75 (2H, m), 3.88 (3H, s), 4.01 (1H, d), 4.50 (1H, d), 6.39 (1H, d), 7.31 (2H, s), 7.39 (1H, s), 8.06 (1H, dd), 8.84 (1H, d).
12-5	1H-NMR (DMSO-d ₆) δ : 2.61-2.72 (1H, m), 2.90-3.01 (1H, m), 3.57-3.66 (2H, m), 3.96 (1H, d), 4.49 (1H, d), 6.67 (1H, d), 7.65 (2H, s), 7.70 (1H, t), 7.97 (1H, dd), 8.66 (1H, d), 12.46 (1H, br s).
12-10	1H-NMR (CDCl ₃) δ : 2.54-2.59 (1H, m), 2.87-2.95 (1H, m), 3.66-3.68 (2H, m), 3.88-3.97 (4H, m), 4.45-4.48 (1H, m), 6.30 (1H, d), 7.28-7.30 (2H, m), 7.39 (1H, s), 8.05-8.08 (1H, m).

生物試驗例 1：斜蚊夜蛾幼蟲試驗

溶劑：3 重量份二甲基甲醯胺；乳化劑：1 重量份聚氧乙烯烷基苯基醚

使甘藷葉浸漬於以水稀釋至指定濃度之試樣溶液中，
 5 待沉積於葉上之溶液風乾後，將所得葉子置入直徑 9 公分之實驗盤(laboratory dish)中，然後於其內釋放 10 隻斜蚊夜蛾第三期幼蟲，接著將實驗盤置入 25°C 之溫度調控室中，隨後於第二天及第四天添加甘藷葉至盤中，7 天後調查死亡昆蟲數以計算殺昆蟲率。

10 此試驗之結果為每組兩個實驗盤之平均值。

Nos.1-3、1-4、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、1-14、1-15、1-16、1-22、1-23、1-25、1-54、1-55、1-56、1-57、1-63、1-73、1-75、1-81、1-83、1-85、1-86、1-87、1-88、1-90、1-91、1-93、2-8、2-23、2-29、2-40、2-41、3-3 與
 15 3-4 諸化合物於 100ppm 活性化合物濃度下，顯示 100%之死亡率。

生物試驗例 2：紅蜘蛛葉蟎試驗(噴霧試驗)

製備活性化合物之適當調配劑時，使 1 重量份活性化合物與含前述量乳化劑之前述量溶劑混合，以水稀釋此混
 20 合物至指定濃度。

接種 50 至 100 隻紅蜘蛛葉蟎成蟲在栽種於 6 公分直徑盆之二葉期菜豆(kidney bean)葉上。一天後，以噴霧槍噴霧大量經稀釋之活性化合物指定濃度之水溶液。噴霧後，將盆保持於溫室 7 天，使用下述評估準則計算殺蟎率：

殺蟎率	
100	所有接種蟎均死亡
98	1至4隻蟎存活/繁殖
90	5至20隻蟎存活/繁殖
60	許多蟎存活/繁殖，惟少於未經處理之對照組，觀察到一些屍體
0	觀察結果與未經處理之對照組無差異

Nos.1-3、1-4、1-7、1-8、1-9、1-10、1-12、1-14、1-15、1-16、1-17、1-20、1-22、1-23、1-25、1-54、1-55、1-56、1-57、1-75、1-81、1-84、1-86、1-87、1-90、2-29、3-3與3-4諸化合物於500ppm活性化合物濃度下，顯示大於5 98%之殺蟎率。

生物試驗例3：黃守瓜甲蟲試驗(噴霧試驗)

溶劑：3重量份二甲基甲醯胺

乳化劑：1重量份聚氧乙烯烷基苯基醚

10 製備活性化合物之適當調配劑時，使1重量份活性化合物與含前述量乳化劑之前述量溶劑混合，以水稀釋此混合物至指定濃度。

15 使黃瓜葉浸漬於以前述試驗相同方法製備之經稀釋之活性化合物指定濃度之水溶液中，風乾，置入含有無菌黑色土壤之塑膠杯中，然後於其內釋放5隻黃守瓜第二蛻期幼蟲，7天後調查死亡幼蟲數以計算死亡率。

Nos. 1-3、1-4、1-7、1-8、1-9、1-10、1-11、1-12、

1-14、1-15、1-16、1-17、1-18、1-20、1-21、1-22、1-23、
1-24、1-25、1-54、1-55、1-56、1-57、1-60、1-61、1-80、
1-81、1-85、1-87、1-88、1-90、1-91、2-29、3-3 與 3-4
諸化合物於 100ppm 活性化合物濃度下，顯示 100%之死亡
5 率。

生物試驗例 4：具有機磷製劑與胺基甲酸酯製劑抗性之桃 蚜(*Myzus persicas*)試驗

溶劑： 3 重量份二甲基甲醯胺

乳化劑： 1 重量份聚氧乙烯烷基苯基醚

10 製備活性化合物之適當調配劑時，使 1 重量份活性化
合物與含前述量乳化劑之前述量溶劑混合，以水稀釋此混
合物至指定濃度。

接種約 30 至 50 隻具有機磷製劑與胺基甲酸酯製劑抗
性之桃蚜成蟲在培植於 6 公分直徑盆之二葉期茄子葉上。
15 接種一天後，以噴霧槍噴霧大量以前述試驗相同方法製備
之經稀釋之活性化合物指定濃度之水溶液。噴霧後，將盆
保持於 28°C 之溫室 7 天，計算死亡率。進行二重複試驗。

Nos. 1-7、1-10、1-14 與 1-16 諸化合物於 500ppm 活
性化合物濃度下，顯示 98%之死亡率。

20 生物試驗例 5：貓蚤試驗

溶劑： 二甲基甲醯胺

製備活性化合物之適當調配劑時，使 10 毫克活性化合
物溶於 0.5 毫升前述溶劑中，以馴養動物血液稀釋此混合

物至指定濃度。

使約 10 至 15 隻貓蚤成蟲保持於跳蚤專用容器中；以實驗用封口膜[PARAFILM (商標)]覆蓋含有血液溶液(其中含有如上述製備之化合物)之另一容器。將含有血液之容器
5 翻轉，置於跳蚤專用容器上；此方式使貓蚤能吸吮容器中之血液。將血液溶液維持於 37°C，跳蚤專用容器維持於室溫。經特定期間後，計算貓蚤死亡率。於此試驗中，100%死亡率意指所有貓蚤死亡；0%死亡率意指所有跳蚤均存活。

10 此生物試驗中，於 100ppm 活性成分濃度下，化合物 1-16 顯示大於 80%之死亡率。

生物試驗例 6：微小牛蟬(*Boophilus microplus*)試驗

溶劑：二甲亞砜

製備活性化合物之適當調配劑時，使 10 毫克活性化合物溶於 0.5 毫升前述溶劑中，以水稀釋此混合物至指定濃度。
15

將如上調配之化合物溶液注射入 5 隻餵飽之微小牛蟬成蟲腹中；將彼等微小牛蟬移至複製盤(replica dish)中，於培育箱中保持特定期間。

20 經特定期間後，計算微小牛蟬之死亡率。於此試驗中，100%死亡率意指所有微小牛蟬死亡；0%死亡率意指所有蟎均存活。

此生物試驗中，於每隻動物 20 微克活性成分之劑量下，化合物 1-16 顯示大於 80%之死亡率。

生物試驗例 7：綿羊綠蠅試驗

溶劑：二甲亞碲

5 製備活性化合物之適當調配劑時，使 10 毫克活性化合物溶於 0.5 毫升前述溶劑中，以水稀釋此混合物至指定濃度。

將約 20 至 30 隻綿羊綠蠅幼蟲置入含有 1 立方公分剝碎的馬肉及 0.5 毫升如上述製備的化合物水溶液之試管中。

經特定期間後，計算綿羊綠蠅之死亡率。於此試驗中，
10 100%死亡率意指所有綿羊綠蠅死亡；0%死亡率意指所有蒼蠅均存活。

此生物試驗中，於 100ppm 活性成分濃度下，化合物 1-16 顯示大於 80%之死亡率。

調配劑實例 1 (粒劑)

15 於含有 10 份根據本發明之化合物(亦即化合物 No.1-3)、30 份皂土(蒙脫石)、58 份滑石與 2 份木質素磺酸鹽之混合物中，添加 25 份水，充分揉捏此混合物並利用擠壓造粒機製出具 10 至 40 篩目之顆粒，於 40 至 50°C 乾燥，獲得粒劑。

20 調配劑實例 2 (粒劑)

將粒徑分佈於 0.2 至 2 毫米範圍內之 95 份黏土礦粒置入旋轉式混合器中，接著於旋轉條件下藉由噴霧與液體稀釋劑一起之 5 份根據本發明之化合物(亦即化合物 No.1-3)

均勻地將其弄濕，於 40 至 50°C 乾燥，獲得粒劑。

調配劑實例 3 (乳液)

30 份根據本發明之化合物(亦即化合物 No.1-3)、55 份二甲苯、8 份聚氧乙烯烷基苯基醚與 7 份烷基苯磺酸鈣一起混合，獲得乳液。

調配劑實例 4 (助濕劑)

15 份根據本發明之化合物(亦即化合物 No. 1-3)、80 份白碳黑(white carbon)(水合非晶氧化矽細粉)與粉末狀黏土(1:5)之混合物、2 份烷基苯磺酸鈉與 3 份烷基萘磺酸鈉-福馬林濃縮物一起混合，將此混合物碾碎，獲得水分散性粉劑。

調配劑實例 5 (可濕性粒劑)

使 20 份根據本發明之活性化合物(亦即化合物 No.1-3)、30 份木質素磺酸鈉、15 份皂土與 35 份經鍛燒之矽藻土粉充分混合，加水後，以 0.3 毫米篩網進行擠壓，乾燥，獲得水分散劑粒劑。

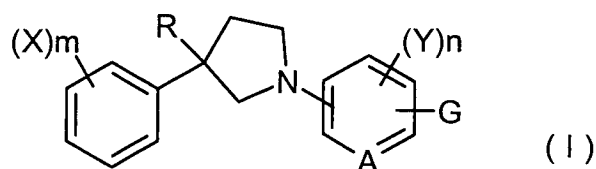
工業利用性

如上述實例所示，本發明之新穎芳基吡咯烷具有作為殺昆蟲劑用之極佳殺昆蟲作用。

五、中文發明摘要：

本發明提供具有極佳殺昆蟲作用之新穎之芳基吡咯烷殺昆蟲劑。

本發明乃有關下式所示之芳基吡咯烷：

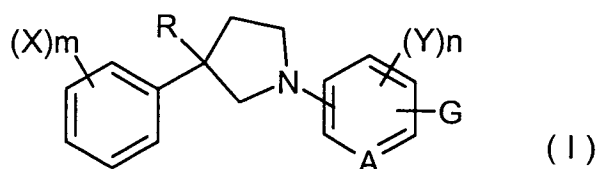


及其作為殺昆蟲劑之用途。

六、英文發明摘要：

The present invention provides novel aryl pyrrolidines having an excellent insecticidal action as insecticides.

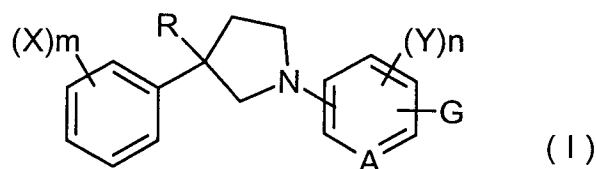
Aryl pyrrolidines represented by the formula:



and use thereof as insecticide.

十、申請專利範圍：

1. 一種由下式(I)所示之芳基吡咯烷



5 式中

X 可相同或不同，代表鹵素、鹵烷基、硝基、烷基、
 烷氧基、氰基、鹵烷氧基、烷硫基、烷基亞磺醯基、
 烷基磺醯基、鹵烷硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基
 磺醯基、羥基、巰基、胺基、烷基羰胺基、鹵烷基
 羰胺基、苯甲醯基胺基、烷氧羰胺基、鹵烷氧羰胺
 基、烷基磺醯基胺基或鹵烷基磺醯基胺基；

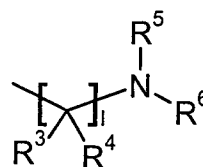
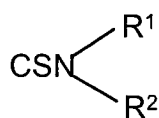
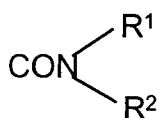
Y 可相同或不同，代表鹵素、鹵烷基、硝基、烷基、
 烷氧基、氰基、鹵烷氧基、烷硫基、烷基亞磺醯基、
 烷基磺醯基、鹵烷硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基
 磺醯基、羥基、巰基、胺基、烷基羰胺基、鹵烷基
 羰胺基、苯甲醯基胺基、烷氧羰胺基、鹵烷氧羰胺
 基、烷基磺醯基胺基或鹵烷基磺醯基胺基；

R 代表烷基或鹵烷基；

m 代表 0、1、2、3、4 或 5；

n 代表 1、2、3 或 4；

G 係選自下述組群



式中

R^1 與 R^2 各自獨立地代表氫；視需要經取代之烷基、烯基、炔基、環烷基或烷基磺醯基；鹵烷基磺醯基或 $\text{CH}_2\text{-R}^7$ ；或一起結合代表 C_{2-6} 伸烷基；

5 R^3 與 R^4 各自獨立地代表氫；氰基；視需要經取代之烷基、烯基、炔基、環烷基；或一起結合代表 C_{2-6} 伸烷基；

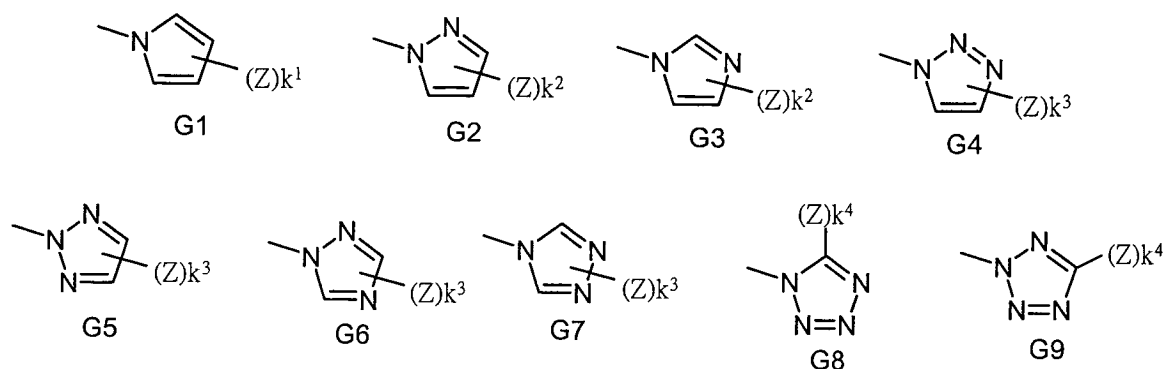
1 代表 1、2 或 3；

10 R^5 代表氫；烷基；視需要經取代之環烷基；鹵烷基；氰基；烯基；炔基；烷羰基或 $\text{CH}_2\text{-R}^7$ ；

15 R^6 代表甲醯基、氰基、烷羰基、烷基硫羰基、鹵烷基羰基、鹵烷基硫羰基、烷胺羰基、烷胺基硫羰基、二烷胺羰基、二烷胺基硫羰基、烷氧胺羰基、烷氧胺基硫羰基、烷氧羰基、烷氧硫羰基、硫基烷氧羰基、硫基烷氧硫羰基、 CO-R^7 、 CS-R^7 、烷基磺醯基或鹵烷基磺醯基；或替代地

20 R^5 與 R^6 於和與彼等連接之氮一起結合形成含有至少一個 N 原子及視需要之選自 S 與 O 之至少一個另外雜原子之 3 至 6 員環，其中該環視需要被酮基或硫酮基取代；

或由雜環 G1 至 G9 構成之基團：



式中

Z 可相同或不同，代表鹵素、鹵烷基、硝基、烷基、烷氧基、氰基、鹵烷氧基、烷基磺醯基、鹵烷基磺醯基、羥基或巰基；

k¹ 代表 0、1、2、3 或 4；

k² 代表 0、1、2 或 3；

k³ 代表 0、1 或 2；

k⁴ 代表 0 或 1；

10 R⁷ 代表苯基或雜環，彼等視需要被選自鹵素與 C₁₋₆ 烷基之至少一個取代基取代；及

A 代表 C 或 N。

2. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中

15 X 可相同或不同，代表鹵素、C₁₋₆ 鹵烷基、硝基、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 烷氧基、氰基、C₁₋₆ 鹵烷氧基、C₁₋₆ 烷硫基、C₁₋₆ 烷基亞磺醯基、C₁₋₆ 烷基磺醯基、C₁₋₆ 鹵烷硫基、C₁₋₆ 鹵烷基亞磺醯基、C₁₋₆ 鹵烷基磺醯基、羥基、巰基、胺基、C₁₋₆ 烷基羰胺基、C₁₋₆ 鹵烷基羰胺基、苯甲醯基胺基、C₁₋₆ 烷氧基-羰胺基、C₁₋₆ 鹵烷氧基-羰胺基、C₁₋₆ 烷基磺醯基胺基或 C₁₋₆

20

鹵烷基磺醯基胺基；

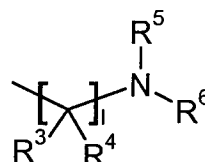
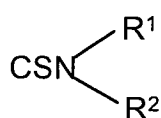
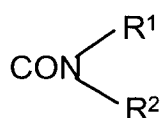
Y 可相同或不同，代表鹵素、C₁₋₆ 鹵烷基、硝基、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 烷氧基、氰基、C₁₋₆ 鹵烷氧基、C₁₋₆ 烷硫基、C₁₋₆ 烷基亞磺醯基、C₁₋₆ 烷基磺醯基、C₁₋₆ 鹵烷硫基、C₁₋₆ 鹵烷基亞磺醯基、C₁₋₆ 鹵烷基磺醯基、羥基、巰基、胺基、C₁₋₆ 烷基羰胺基、C₁₋₆ 鹵烷基羰胺基、苯甲醯基胺基、C₁₋₆ 烷氧基-羰胺基、C₁₋₆ 鹵烷氧基-羰胺基、C₁₋₆ 烷基磺醯基胺基或 C₁₋₆ 鹵烷基磺醯基胺基；

R 代表 C₁₋₆ 烷基或 C₁₋₆ 鹵烷基；

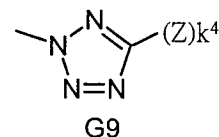
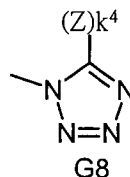
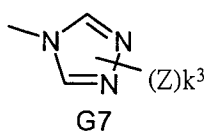
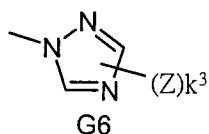
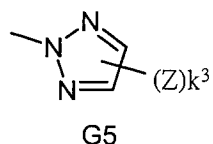
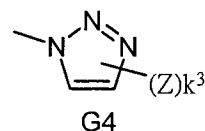
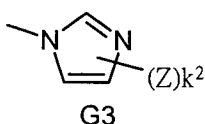
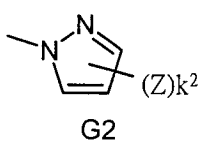
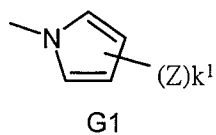
m 代表 0、1、2、3、4 或 5；

n 代表 0、1、2、或 4；

G 係選自下述組群



或由雜環 G1 至 G9 構成之基團：



式中

R¹ 與 R² 各自獨立地代表氫；視需要經取代之 C₁₋₆ 烷

基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 炔基、 C_{3-7} 環烷基； C_{1-6} 烷基磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷基磺醯基、或 CH_2-R^7 ；或一起結合代表 C_{2-6} 伸烷基；

R^3 與 R^4 各自獨立地代表氫、氰基；視需要經取代之 C_{1-6} 烷基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 炔基、 C_{3-7} 環烷基；或 C_{1-6} 烷氧羰基；或一起結合代表 C_{2-6} 伸烷基；

1 代表 1 或 2 或 3；

R^5 代表氫； C_{1-6} 烷基；視需要經取代之 C_{3-7} 環烷基； C_{1-6} 鹵烷基；氰基； C_{2-6} 烯基； C_{2-6} 炔基； C_{1-6} 烷羰基；或 CH_2-R^7 ；

R^6 代表甲醯基、氰基、 C_{1-6} 烷羰基、 C_{1-6} 烷基硫羰基、 C_{1-6} 鹵烷基-羰基、 C_{1-6} 鹵烷基硫羰基、 C_{1-6} 烷胺羰基、 C_{1-6} 烷胺基硫羰基、具有 2 至 8 個碳原子之二烷胺基-羰基、具有 2 至 8 個碳原子之二烷胺基硫羰基、 C_{1-6} 烷氧胺羰基、 C_{1-6} 烷氧胺基硫羰基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷氧硫羰基、 C_{1-6} 硫基烷氧羰基、 C_{1-6} 硫基烷氧硫羰基、 $CO-R^7$ 、 $CS-R^7$ 、 C_{1-6} 烷基磺醯基、或 C_{1-6} 鹵烷基磺醯基；或

R^5 與 R^6 於和與彼等連接之氮一起結合形成含有至少一個 N 原子及視需要之選自 S 與 O 之至少一個另外雜原子之 3 至 6 員環，其中該環視需要被酮基或硫酮基取代；

Z 可相同或不同，代表鹵素、 C_{1-6} 鹵烷基、硝基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基、氰基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{1-6} 烷

基磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷基磺醯基、羥基或巰基；

k^1 代表 0、1、2、3 或 4；

k^2 代表 0、1、2 或 3；

k^3 代表 0 或 1；

5 k^4 代表 0 或 1；

R^7 代表苯基或雜環，彼等視需要被選自氟、氯、溴、碘與 C_{1-6} 烷基之至少一個取代基取代；及

A 代表 C 或 N 者。

3. 一種殺昆蟲性組成物，其包含根據申請專利範圍第 1
10 或 2 項之至少一種化合物。

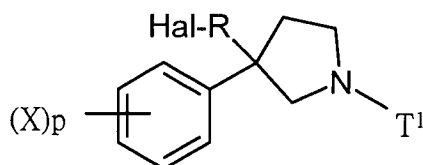
4. 一種用於防治昆蟲及/或蜚蟎之方法，該方法包括使用根據申請專利範圍第 3 項之組成物處理有害昆蟲及/或蜚蟎及/或其棲息處之步驟。

5. 一種使用根據申請專利範圍第 1 或 2 項之化合物防治有
15 害昆蟲及/或蜚蟎之用途。

6. 一種使用根據申請專利範圍第 1 或 2 項之化合物處理種子之用途。

7. 一種使用根據申請專利範圍第 1 或 2 項之化合物處理基因轉殖植物之用途。

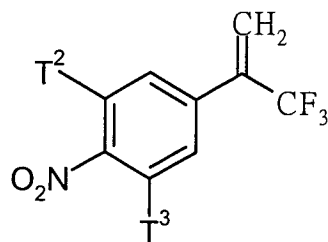
20 8. 一種由下式(IIa)所示化合物



式中 X 如申請專利範圍第 1 或 2 項所界定，T¹ 代表氫

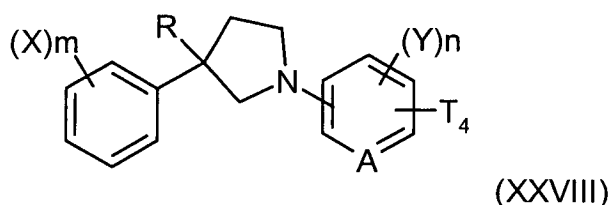
或苄基，Hal-R 代表鹵烷基，及 p 代表 1、2、3、4 或 5。

9. 一種由下式 (XVI-a) 所示化合物

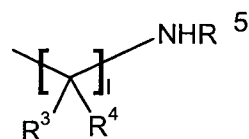
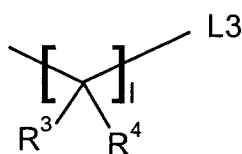
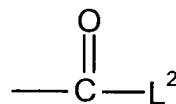
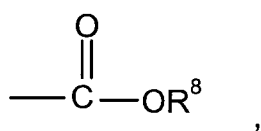


式中 T^2 與 T^3 獨立地代表烷基。

5 10. 一種由下式 (XXVIII) 所示化合物



式中 X、Y、R、A、m 與 n 如申請專利範圍第 1 或 2 項所界定及 T^4 代表氰基、胺基、硝基或下述基團：



式中

- 10 1、 R^3 、 R^4 、 R^5 與 R^6 如申請專利範圍第 1 或 2 項所界定；
 R^8 代表氫或 C_{1-4} 烷基；
 L^2 代表氯、溴、 C_{1-4} 烷羰氧基、 C_{1-4} 烷氧羰氧基或唑基；及

L³ 代表氯、溴、碘、C₁₋₄ 烷基磺酰氧基、C₁₋₄ 卤烷基磺酰氧基、芳基磺酰氧基或唑基。

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第（ 無 ）圖。

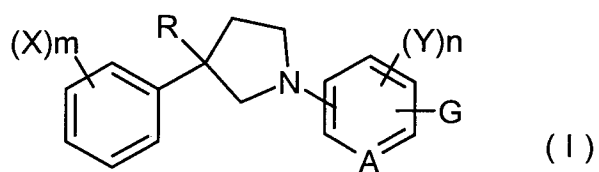
(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

無

5

10

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係有關新穎之芳基吡咯烷及其作為殺昆蟲劑之用途。

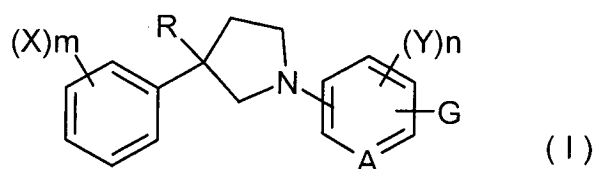
5 【先前技術】

WO2005/085216敘述異噁唑啉經取代之苯甲醯胺化合物可作為害物防治劑用。

10 本發明人等經精心研究以開發對動物害物(例如昆蟲及蟬蟎)展現較高效力及廣譜之新穎化合物。結果，本發明人等發現顯示極佳(亦即高)活性、具有廣譜且對益蟲(例如蜜蜂)無害，以及對昆蟲害物(特別是對殺昆蟲劑，例如有機磷或胺基甲酸酯製劑具抗性之該等昆蟲)具效力之新穎之芳基吡咯烷。

【發明內容】

15 根據本發明之化合物係以式(I)表示



式中

20 X 可相同或不同，代表鹵素、鹵烷基、硝基、烷基、烷氧基、氰基、鹵烷氧基、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷基磺醯基、鹵烷硫基、鹵烷基亞磺醯基、鹵烷基磺醯基、羥基、巰基、胺基、烷基羰胺基、鹵烷基羰胺基、苯甲醯基胺基、烷氧基-羰胺基、鹵烷氧羰胺基、烷基磺醯基胺基或鹵烷基磺醯基胺基；

25 Y 可相同或不同，代表鹵素、鹵烷基、硝基、烷基、烷氧基、氰基、鹵烷氧基、烷硫基、烷基亞磺醯基、烷

用於家畜、家禽、馴養動物等時，根據本發明之活性化合物可呈活性化合物含量為 1 至 80 重量%之調配劑(例如粉劑、可濕性粉劑[“WP”]、乳液、可乳化濃縮物[“EC”]、流動性物質、均質溶液及懸浮液濃縮物[“SC”])，直接或於
5 稀釋(例如 100 至 10 000 倍稀釋)後，或者呈化學浴施用。

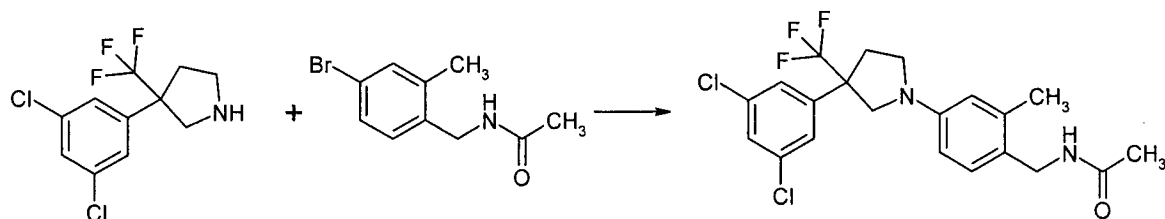
用於獸醫領域時，根據本發明之活性化合物可組合適當增效劑或其他活性化合物(舉例而言，如，殺蟎劑、殺昆蟲劑、驅蟲劑、抗原生動物藥物)使用。

茲藉由下述實例更具體說明本發明；然而，本發明絕
1、不擬受限於彼等實例。

【實施方式】

合成實例 1

N-{4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-甲基苄基}乙醯胺(No.3-11)之合成



15

20

氬氣氛圍下，添加第三丁醇鈉(0.3 克)、參(二亞苄基丙酮)二鈣(0)(氯仿加合物)(0.04 克)與 Xantphos (0.07 克)至 3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷(0.59 克)與 N-(4-溴-2-甲基苄基)乙醯胺(0.5 克)之甲苯溶液中，此混合物於
80°C，攪拌下，加熱 5 小時。以第三丁基甲基醚稀釋反應溶液，然後以水與鹽水洗滌。其有機層以無水硫酸鎂乾燥；減壓蒸除溶劑，然後利用矽膠層析法純化殘留物，得到
N-{4-[3-(3,5-二氯苯基)-3-(三氟甲基)吡咯烷-1-基]-2-甲基