



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201216847 A1

(43)公開日：中華民國 101 (2012) 年 05 月 01 日

(21)申請案號：100124062

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 07 月 07 日

(51)Int. Cl. : *A01N43/28 (2006.01)*

A01N25/00 (2006.01)

(30)優先權：2010/07/07 日本

2010-154796

2011/03/31 日本

2011-077912

(71)申請人：明治製菓藥業股份有限公司 (日本) MEIJI SEIKA PHARMA CO., LTD. (JP)

日本

國立大學法人岐阜大學 (日本) GIFU UNIVERSITY (JP)

日本

(72)發明人：利部伸三 KAGABU, SHINZO (JP)；三富正明 MITOMI, MASAOKI (JP)；橘田繁

輝 KITSUDA, SHIGEKI (JP)；野村昌弘 NOMURA, MASAHIRO (JP)；中村哲

NAKAMURA, SATOSHI (JP)；山本一美 YAMAMOTO, KAZUMI (JP)

(74)代理人：林志剛

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：10 項 圖式數：0 共 80 頁

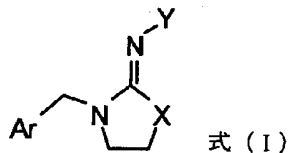
(54)名稱

有害生物防除劑

(57)摘要

本發明係提供使用至少一種下述化學式(I)所示之亞胺衍生物的有害生物防除劑。

【化 1】





(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201216847 A1

(43)公開日：中華民國 101 (2012) 年 05 月 01 日

(21)申請案號：100124062

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 07 月 07 日

(51)Int. Cl. : A01N43/28 (2006.01)

A01N25/00 (2006.01)

(30)優先權：2010/07/07 日本

2010-154796

2011/03/31 日本

2011-077912

(71)申請人：明治製菓藥業股份有限公司 (日本) MEIJI SEIKA PHARMA CO., LTD. (JP)

日本

國立大學法人岐阜大學 (日本) GIFU UNIVERSITY (JP)

日本

(72)發明人：利部伸三 KAGABU, SHINZO (JP)；三富正明 MITOMI, MASAOKI (JP)；橘田繁

輝 KITSUDA, SHIGEKI (JP)；野村昌弘 NOMURA, MASAHIRO (JP)；中村哲

NAKAMURA, SATOSHI (JP)；山本一美 YAMAMOTO, KAZUMI (JP)

(74)代理人：林志剛

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：10 項 圖式數：0 共 80 頁

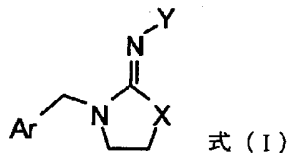
(54)名稱

有害生物防除劑

(57)摘要

本發明係提供使用至少一種下述化學式(I)所示之亞胺衍生物的有害生物防除劑。

【化 1】



六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於利用亞胺衍生物的新穎有害生物防除劑

。

【先前技術】

目前為止雖有多種有害生物防除劑，但因藥劑感受性的降低、效果之持續性、使用時的安全性等問題而更追求新穎藥劑。

關於亞胺衍生物用於有害生物防除，有關於農業領域中作為殺蟲劑使用之報告（專利文獻 1~3、非專利文獻 1）。

然而，此等文獻中，並無關於用在動物寄生性害蟲防除或衛生害蟲防除的具體記載。

[先前技術文獻]

[專利文獻]

[專利文獻 1]特開昭 63-150275 號公報

[專利文獻 2]特表 2007-506674 號公報

[專利文獻 3]國際公開 2010-001922 號公報

[非專利文獻]

[非專利文獻 1]Chemical Research in Toxicology, 2009,22 (3) ,476-482

【發明內容】

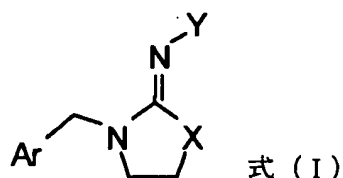
[發明所欲解決之課題]

本發明係以提供新穎有害生物防除劑為課題。

[解決課題之手段]

為解決上述課題，本發明者們提供使用至少 1 種下述化學式 (I) 所示之亞胺衍生物的有害生物防除劑。

【化 1】



亦即根據本發明，提供使用至少 1 種化學式 (I) 所示之亞胺衍生物之有害生物防除劑 (式中，Ar 為環上可具有取代基的雜環基，X 為硫原子或 CH₂、NR，Y 為 COR₁、CONR₃R₄、CONHCOR₅、或 CO₂R₉。R 為氫原子或烷基。

Y 為 COR₁ 之場合，R₁ 為氫原子或 C1~C18 之烷基、C1~C18 之鹵素化烷基、C2~C18 之烯基、C2~C18 之鹵素化烯基、C2~C18 之炔基、C2~C18 之鹵素化炔基、取代或無取代 C6~C10 之芳基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C1~C8) 烷基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C2~C8) 烯基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C2~C8) 炔基、取代或無取代 (C1~C4) 烷氧基 (C1~C5) 烷基、取代或無

取代 (C1~C4) 烷氧基 (C2~C5) 烯基、取代或無取代 (C1~C4) 烷氧基 (C2~C5) 炔基、C1~C3 之烷氧基羰基、(C1~C3) 烷基磺醯基 (C1~C3) 烷基、(C1~C4) 烷基硫基 (C1~C5) 烷基、C3~C12 之取代或無取代環烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C1~C8) 烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C8) 烯基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C8) 炔基、氰 (C1~C3) 烷基、取代或無取代苯氧基 (C1~C8) 烷基、取代或無取代苯氧基 (C2~C8) 烯基、取代或無取代苯氧基 (C2~C8) 炔基、取代或無取代雜環 (C1~C8) 烷基、取代或無取代雜環 (C2~C8) 烯基、取代或無取代雜環 (C2~C8) 炔基、取代或無取代雜環氧基 (C1~C8) 烷基、取代或無取代雜環氧基 (C2~C8) 烯基、取代或無取代雜環氧基 (C2~C8) 炔基、呋喃基、嗎啉基、降冰片烯基、金剛烷基、異硫基氰氧基甲基、玫瑰寧基、或取代或無取代之雜環或芳香環、(C1~C5) 烷基羰基胺基 (C1~C3) 烷基、(C1~C5) 烷基氧基羰基胺基氧基甲基、(C1~C5) 烷基氧基羰基胺基甲基、(C1~C5) 烷基羰基氧基甲基、

Y 為 CONR_3R_4 之場合， R_3 與 R_4 各自為氫原子或 C1~C5 之烷基、C1~C5 之鹵素化烷基、C2~C5 之烯基、C2~C5 之鹵素化烯基、C2~C5 之炔基、C2~C5 之鹵素化炔基、C1~C3 之烷氧基、烯基氧基、取代或無取代 C6~C10 之芳基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C1~C8) 烷基、

取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C2~C8) 烯基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C2~C8) 炔基、(C1~C4) 烷氧基 (C1~C5) 烷基、(C1~C4) 烷氧基 (C2~C5) 烯基、(C1~C4) 烷氧基 (C2~C5) 炔基、C1~C3 之烷氧基羰基甲基、(C1~C4) 烷基硫基 (C1~C5) 烷基、C3~C12 之取代或無取代環烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基、取代或無取代吡啶基甲基、取代或無取代苯磺醯基、(C1~C5) 烷基胺基、取代或無取代苯基胺基、(C1~C5) 烷基羰基胺基、取代或無取代苯甲醯基胺基。NR₃R₄ 亦可形成環。

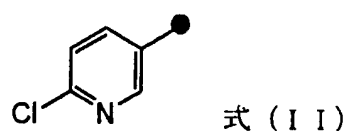
Y 為 CONHCOR₅ 之場合，R₅ 為氫原子或 C1~C5 之烷基、C1~C5 之鹵素化烷基、C2~C5 之烯基、C2~C5 之鹵素化烯基、取代或無取代 C6~C10 之芳基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C1~C5) 烷基，

Y 為 CO₂R₉ 之場合，R₉ 為氫原子或 C1~C18 之烷基、C1~C18 之鹵素化烷基、C2~C18 之烯基、C2~C18 之鹵素化烯基、C2~C18 之炔基、C2~C18 之鹵素化炔基、取代或無取代 C6~C10 之芳基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C1~C8) 烷基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C2~C8) 烯基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C2~C8) 炔基、取代或無取代 (C1~C4) 烷氧基 (C1~C5) 烷基、取代或無取代 (C1~C4) 烷氧基 (C2~C5) 烯基、取代或無取代 (C1~C4) 烷氧基 (C2~C5) 炔基、(C1~C4) 烷基硫基 (C1~C5) 烷基、三 (C1~C3 烷基) 矽烷基 (C1~C3) 烷基

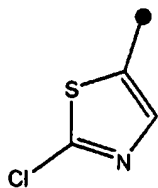
、C3~C12 之取代或無取代環烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C1~C8) 烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C8) 烯基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C8) 炔基、(C1~C4) 烷基硫基 (C1~C5) 烷基、(C1~C3) 烷基磺基 (C1~C3) 烷基、取代或無取代苯氧基 (C1~C8) 烷基、取代或無取代苯氧基 (C2~C8) 烯基、取代或無取代苯氧基 (C2~C8) 炔基、取代或無取代雜環 (C1~C8) 烷基、取代或無取代雜環 (C2~C8) 烯基、取代或無取代雜環 (C2~C8) 炔基、取代或無取代雜環氧基 (C1~C8) 烷基、取代或無取代雜環氧基 (C2~C8) 烯基、取代或無取代雜環氧基 (C2~C8) 炔基、琥珀醯亞胺基、18-冠-6-甲基。又，以上之碳鏈可以鹵素取代。

較佳態樣方面，提供至少含一種化學式 (I) (式中，Ar 以下述化學式 (II) 或 (III) 所表示、X、Y 與上述同義。) 所示之化合物而成的有害生物防除劑。

【化2】



【化3】



式 (III)

另外較佳態樣方面，提供上述化學式 (I) 所表示之亞胺衍生物為以下表所示之化合物的有害生物防除劑。

[表1]

化合物編號	Y	X	Ar	化合物編號	Y	X	Ar
8	CO-phenyl	S	(II)	230	COCH ₂ OCOMe	S	(II)
42	COOMe	S	(II)	233	COCH ₂ ONHCOOEt	S	(II)
43	COOC ₃ H _{7-n}	S	(II)	240	COCF ₃	S	(II)
44	COOC ₃ H _{7-i}	S	(II)	241	COCF ₃	S	(III)
45	COOCH ₂ CH ₂ Cl	S	(II)	244	COO-3-methoxyphenyl	S	(II)
57	COPh	S	(III)	251	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ NO ₂	S	(II)
61	CHO	S	(III)	255	COOCH ₂ CH ₂ morpholinyl	S	(II)
72	COMe	S	(II)	267	CO-3-methylphenyl	S	(II)
76	COCHF ₂	S	(II)	268	CO-2-fluorophenyl	S	(II)
81	COCH ₂ CH ₂ OMe	S	(II)	282	CO-2-fluorophenyl	S	(III)
83	COGH=CH ₂	S	(II)	299	CO-phenyl	S	4,5-dichloro-3-pyridyl
106	CONHOMe	S	(II)	302	CO-phenyl	S	4-bromo-3-pyridyl
107	CONHOEt	S	(II)	303	GOOCH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(II)
113	COOEt	S	(II)	308	GOCH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(II)
114	GOOCH ₂ CH ₂ F	S	(II)	309	GOCH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(II)
115	GOOCH ₂ CHF ₂	S	(II)	313	GOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(III)
122	GOOCH ₂ CH ₂ CH ₂ F	S	(II)	326	GOCH ₂ -(2-tetrahydrofuranlyl)	S	(II)
123	GOOCH(CH ₂ F) ₂	S	(II)	328	GOCH ₂ CH ₂ -(2-thienyl)	S	(II)
124	GOOCH(Me)CF ₃	S	(II)	329	GOOCH ₂ CH ₂ -(2-tetrahydrofuranlyl)	S	(II)
125	GOOCH(CF ₃) ₂	S	(II)	336	GOOCH ₂ CH ₂ -(2-tetrahydrofuranlyl)	S	(II)
128	GOO-n-butyl	S	(II)	337	GOOCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-furanyl)	S	(II)
132	GOOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	S	(II)	338	GOOCH ₂ CH ₂ -(3-tetrahydrofuranlyl)	S	(II)
134	GOOCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	S	(II)	341	GO-CH ₂ CH ₂ -(3-furanyl)	S	(II)
135	GOOCH ₂ CH=CMe ₂	S	(II)	343	GOCH ₂ CH ₂ -(4-methoxyphenyl)	S	(II)
139	GOO-CH ₂ -cyclopropyl	S	(II)	345	GOCH ₂ CH ₂ -(3,5-dimethoxyphenyl)	S	(II)
140	GOOCH ₂ -2-oxiranyl	S	(II)	349	GOOCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-furanyl)	S	(II)
141	GOO-cyclobutyl	S	(II)	351	GOO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-tetrahydrofuranlyl)	S	(II)
144	GOOCH ₂ -3-tetrahydrofuranlyl	S	(II)	352	GOOCH ₂ CH ₂ -(2-thienyl)	S	(II)
145	GOOCH ₂ -(2,2-dimethyl-1,3-dioxolan-4-yl)	S	(II)	354	GOOCH ₂ CH ₂ -(3-thienyl)	S	(II)
155	GOCH ₂ -3-thienyl	S	(II)	355	GOCH ₂ CH ₂ -(benzo[d][1,3]dioxol-5-yl)	S	(II)
167	GOO-iso-propyl	S	(III)	358	GOCH ₂ CH ₂ -(3-methoxyphenyl)	S	(II)
171	GOOCH ₂ C≡CH	S	(II)	359	GOOCH ₂ CH ₂ -(2-furanyl)	S	(II)
198	GO-4-t-butylphenyl	S	(III)	366	GOOCH ₂ -(2-thienyl)	S	(II)
211	GOO-n-pentyl	S	(II)	374	GOCH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(II)
213	GO-2,2-difluorocyclopropyl	S	(II)	430	GOCH ₂ CH ₂ -(2-furanyl)	S	(II)
216	GOCH ₂ CH ₂ CF ₃	S	(II)	431	GOCH ₂ CH ₂ -(3-furanyl)	S	(II)
226	GOO-n-hexyl	S	(II)				
227	GOOCH ₂ t-Bu	S	(II)				
228	GOO-CH ₂ -Crownether(18-C-8)	S	(II)				

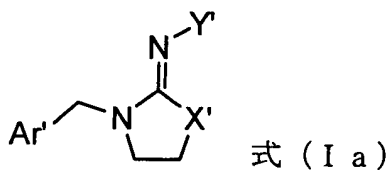
另外較佳態樣方面，提供有害生物為動物寄生性害蟲

之有害生物防除劑。

尤佳態樣方面，提供有害生物為動物寄生性蜚類之有害生物防除劑。

本發明之第二態樣方面，提供化學式 (Ia) 所示之化合物。

【化4】

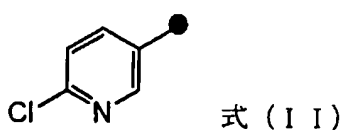


(式中，Ar'為環上可具有取代基的雜環基，X'為硫原子，Y'為COR₁'、或CO₂R₉'。

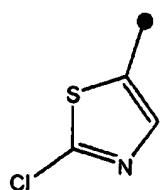
Y'為COR₁'之場合，R₁'為取代苯基(C₂~C₄)烷基、3員環~7員環之取代或無取代雜環烷基(C₂~C₃)烷基、取代或無取代雜環(C₂~C₃)烷基、取代或無取代(C₁~C₄)烷氧基甲基、3員環~7員環的雜環烷基、取代或無取代雜環，

Y'為CO₂R₉'之場合，R₉'為取代或無取代苯基(C₂~C₄)烷基、3員環~7員環之取代或無取代雜環烷基(C₂~C₃)烷基、取代或無取代雜環(C₂~C₃)烷基。)

【化5】



【化6】



式 (I I I)

本發明之第三態樣方面，提供使用上述有害生物防除劑防除有害生物的方法。

[發明之效果]

根據本發明，而可有效防除動物寄生性害蟲等之有害生物。

[實施發明之最佳形態]

本發明提供的有害生物防除劑係指農業領域以外使用之有害生物防除劑。例如動物寄生性害蟲、衛生害蟲、不愉快害蟲、儲穀、儲藏食品害蟲、居家害蟲等防除劑，較佳為動物寄生性害蟲的防除劑，更佳為動物寄生性殺蟬劑。

化學式 (I) 中，Ar 為可在環上具有取代基的雜環。5 員或 6 員環的雜環的具體例方面，可舉例如吡啶、噻唑、四氫呋喃、呋喃等。尤以 3-吡啶基、5-噻唑基、3-四氫呋喃基為佳。

又，雜環之取代基方面雖未特別限定，可舉例如鹵素原子（氟、氯、溴、碘之任意皆可）、C1~C4 之烷基、C1~C4 之鹵素化烷基、C1~C4 之烷氧基、二（C1~C4 之烷

基) 胺基、硝基等。

化學式 (I) 中, X 為硫原子或 CH_2 、NR, R 為氫原子、烷基。烷基為 C1~C4 之烷基且 1 級、2 級、3 級之任意皆可, 例如甲基、乙基、n-丙基、異丙基、n-丁基、異丁基、sec-丁基、tert-丁基等。較佳為 X 係硫原子。

R_1 、 R_9 表示的 C1~C18 之烷基、及 R_1 、 R_9 表示的 C1~C18 之鹵素化烷基之烷基為 1 級、2 級、3 級之任意皆可, 例如甲基、乙基、n-丙基、異丙基、n-丁基、異丁基、sec-丁基、tert-丁基、n-戊基、n-己基、n-癸基、n-十七基等。 R_1 較佳為 C1~C4、更佳為 C1~C3 鹵素化烷基, R_9 較佳為 C1~C6、更佳為 C3、C4 之鹵素化烷基。

R_3 、 R_4 、 R_5 表示的 C1~C5 烷基、及 R_3 、 R_4 、 R_5 表示的 C1~C5 鹵素化烷基之烷基為 1 級、2 級、3 級之任意皆可, 例如甲基、乙基、n-丙基、異丙基、n-丁基、異丁基、sec-丁基、tert-丁基等。較佳為 C1~C3 之烷基。

R_1 、 R_9 表示的 C2~C18 之烯基、及 R_1 、 R_9 表示的 C2~C18 之鹵素化烯基之烯基為 1 級、2 級、3 級之任意皆可, 例如乙烯基、2-丙烯基、3-丁烯基、4-戊烯基、5-己烯基、9-癸烯基、16-十七烯基等。 R_1 較佳為 C2~C6 烯基、更佳為 C4~C6 烯基, R_9 較佳為 C3~C6 烯基, 更佳為 C5~C6 烯基。

R_3 、 R_4 、 R_5 表示的 C2~C5 之烯基、及 R_3 、 R_4 、 R_5 表示的 C2~C5 之鹵素化烯基之烯基為 1 級、2 級、3 級之任意皆可, 例如乙烯基、2-丙烯基、3-丁烯基。

R_1 、 R_9 表示的 C2~C18 之炔基、及 R_1 、 R_9 表示的 C2~C18 之鹵素化炔基之炔基為 1 級、2 級、3 級之任意皆可，例如 1-丙炔基、2-丙炔基、3-丁炔基、4-戊炔基、5-己炔基、9-癸炔基、16-十七炔基等。 R_1 較佳為 C3~C6 炔基、更佳為 C4~C6 炔基， R_9 較佳為 C3~C6 之炔基，更佳為 C3、C4 之炔基。

R_3 、 R_4 表示的 C2~C5 之炔基、及 R_3 、 R_4 表示的 C2~C5 之鹵素化炔基之炔基為 1 級、2 級、3 級之任意皆可，例如 1-丙炔基、2-丙炔基、3-丁炔基、4-戊炔基等。

R_3 、 R_4 表示的 C1~C3 烷氧基為 1 級或 2 級之任意皆可，例如甲氧基、乙氧基等。較佳為 C1~C2 之烷氧基。

R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_9 表示的取代或無取代 C6~C10 之芳基，具體上為苯基、萘基。亦可取代的取代基方面，可舉例如鹵素原子、可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基、可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基、C3~C6 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等，又在相鄰碳取代的取代基可一起為 -O-(CH₂)_n-O-（在此 n 為 1 或 2）。

R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_9 表示的取代或無取代（C6~C10）芳基（C1~C8）烷基之（C6~C10）芳基，具體上為苯基、萘基，（C1~C8）烷基可具有直鏈、分支、或環。亦可取代的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基，可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基、C3~C6 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等，且在相鄰碳取代的取代基可一起為 -O-(CH₂)_n-O-（在此 n 為 1 或 2）。

)。取代或無取代 (C₆~C₁₀) 芳基 (C₁~C₈) 烷基之例方面，如苄基、1-苯基乙基、2-苯基乙基、1-苯基-2-甲基丙基、苯基環丙基、3-苯基環丁基、1-苯基-1-甲基乙基、2-(3-甲氧基苯基)乙基等，R₁ 較佳為取代或無取代苯基 (C₁~C₄) 烷基，更佳為取代苯基 (C₂~C₄) 烷基，具體上為苄基、1-苯基乙基、2-苯基乙基、1-苯基-1-甲基乙基、1-苯基環丙基、2-(2-甲氧基苯基)乙基、2-(3-甲氧基苯基)乙基、2-(4-甲氧基苯基)乙基、2-(3,5-二甲氧基苯基)乙基、2-(2,3-二氫苯並[b][1,4]二奧辛-6-基)乙基、2-(苯並[d][1,3]二氧雜環戊二烯-5-基)乙基、2-(2-甲氧基苯基)丙基等，更佳為 2-(2-甲氧基苯基)乙基、2-(3-甲氧基苯基)乙基、2-(4-甲氧基苯基)乙基、2-(3,5-二甲氧基苯基)乙基、2-(2,3-二氫苯並[b][1,4]二奧辛-6-基)乙基、2-(苯並[d][1,3]二氧雜環戊二烯-5-基)乙基等，R₉ 較佳為取代或無取代苯基 (C₁~C₄) 烷基，具體上為 3-甲氧基苄基、2-(3-甲氧基苯基)乙基等。

R₁、R₃、R₄、R₉ 表示的取代或無取代 (C₆~C₁₀) 芳基 (C₂~C₈) 烯基之 (C₆~C₁₀) 芳基，具體上為苯基、萘基，(C₂~C₈) 烯基可具有直鏈、分支、或環。亦可取代的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C₁~C₄ 之烷基，可以鹵素取代的 C₁~C₄ 烷基氧基、C₃~C₆ 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等，且在相鄰碳取代的取代基可一起為 -O-(CH₂)_n-O- (在此 n 為 1 或 2)。

取代或無取代 (C₆~C₁₀) 芳基 (C₁~C₅) 烯基之例方面

，如 2-苯基乙烯基、3-苯基-2-丙烯基、苯基環丙烯基、4-苯基-3-丁烯基等。R₁ 較佳為 2-苯基乙烯基，R₉ 較佳為 3-苯基-2-丙烯基。

R₁、R₃、R₄、R₉ 表示的取代或無取代 (C₆~C₁₀) 芳基 (C₂~C₈) 炔基之 (C₆~C₁₀) 芳基，具體上為苯基、萘基，(C₂~C₈) 炔基可具有直鏈、分支、或環。亦可取代的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C₁~C₄ 之烷基，可以鹵素取代的 C₁~C₄ 烷基氧基、C₃~C₆ 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等，且在相鄰碳取代的取代基可一起為 -O-(CH₂)_n-O- (在此 n 為 1 或 2)。取代或無取代 (C₆~C₁₀) 芳基 (C₁~C₅) 炔基之例方面，可舉例如 2-苯基乙炔基等。

R₁、R₃、R₄、R₉ 表示的取代或無取代 (C₁~C₄) 烷氧基 (C₁~C₅) 烷基之、(C₁~C₄) 烷氧基為具有直鏈、分支、或環之 (C₁~C₄) 烷基氧基、烯基氧基、或炔基氧基，亦可取代之取代基方面，如鹵素原子、C₃~C₆ 之環狀烷基、苯基、3 員環~7 員環的雜環烷基、取代或無取代雜環等。苯基可被鹵素原子，可以鹵素取代的 C₁~C₄ 之烷基，可以鹵素取代的 C₁~C₄ 烷基氧基、C₃~C₆ 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基所取代，且在相鄰碳取代的取代基可一起為 -O-(CH₂)_n-O- (在此 n 為 1 或 2)。雜環烷基可被鹵素取代。又，雜環可被鹵素取代。取代或無取代 (C₁~C₄) 烷氧基 (C₁~C₅) 烷基之 (C₁~C₅) 烷基可具有直鏈、分支、或環。(C₁~C₄) 烷氧基 (

C1~C5) 烷基之例方面，可舉例如甲基氧基甲基、乙基氧基甲基、甲基氧基乙基、乙基氧基乙基、異丙基氧基甲基、t-丁基氧基甲基等，R1 表示的取代或無取代 (C1~C4) 烷氧基 (C1~C5) 烷基，較佳為取代或無取代 (C1~C4) 烷氧基 (C1~C3) 烷基，更佳為取代或無取代 (C1~C4) 烷氧基甲基，具體上如甲氧基甲基、乙氧基甲基、乙炔基氧基甲基、(3,3,3-三氟丙基氧基) 甲基、(4,4,4-三氟丁基氧基) 甲基、(2-呋喃基甲基氧基) 甲基、(3-呋喃基甲基氧基) 甲基、(2-四氫呋喃基甲基氧基) 甲基、(3-四氫呋喃基甲基氧基) 甲基、2-(2-甲氧基苯基) 乙基氧基甲基、2-(2-氟苯基) 乙基氧基甲基、較佳為甲氧基甲基、乙氧基甲基、乙炔基氧基甲基、(3,3,3-三氟丙基氧基) 甲基、(4,4,4-三氟丁基氧基) 甲基、(2-呋喃基甲基氧基) 甲基、(3-呋喃基甲基氧基) 甲基等，R9 較佳為甲氧基 (C3~C4) 烷基。

R₁、R₃、R₄、R₉ 表示的取代或無取代 (C1~C4) 烷氧基 (C2~C5) 烯基之 (C1~C4) 烷氧基為具有直鏈、分支、或環之 (C1~C4) 烷基氧基、烯基氧基、或炔基氧基，亦可取代之取代基方面，如鹵素原子、C3~C6 之環狀烷基、苯基、3 員環~7 員環的雜環烷基、取代或無取代雜環等。苯基可被鹵素原子、可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基，可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基、C3~C6 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基所取代，且在相鄰碳取代的取代基可一起為 -O-(CH₂)_n-O- (在此 n 為 1 或 2)。

雜環烷基可被鹵素取代。又，雜環可被鹵素取代。取代或無取代（C1~C4）烷氧基（C2~C5）烯基之（C2~C5）烯基可具有直鏈、分支、或環。取代或無取代（C1~C4）烷氧基（C2~C5）烯基之例方面，如 2-甲氧基乙烯基、2-乙氧基乙烯基、3-甲氧基-2-丙烯基、3-乙氧基-2-丙烯基、（2-呋喃基甲基氧基）乙烯基、（3-呋喃基甲基氧基）乙烯基、（2-四氫呋喃基甲基氧基）乙烯基、（3-四氫呋喃基甲基氧基）乙烯基等。

R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_9 表示的取代或無取代（C1~C4）烷氧基（C2~C5）炔基之（C1~C4）烷氧基為具有直鏈、分支、或環之（C1~C4）烷基氧基、烯基氧基、或炔基氧基，亦可取代之取代基方面，如鹵素原子、C3~C6 之環狀烷基、苯基、3 員環~7 員環的雜環烷基、取代或無取代雜環等。苯基可被鹵素原子，可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基，可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基、C3~C6 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基所取代，且在相鄰碳取代的取代基可一起為 $-O-(CH_2)_n-O-$ （在此 n 為 1 或 2）。雜環烷基可被鹵素取代。又，雜環可被鹵素取代。取代或無取代（C1~C4）烷氧基（C2~C5）炔基之（C2~C5）炔基可具有直鏈、分支、或環。取代或無取代（C1~C4）烷氧基（C2~C5）炔基之例方面，如 2-甲氧基乙炔基、2-乙氧基乙炔基、3-甲氧基-2-丙炔基、3-乙氧基-2-丙炔基、（2-呋喃基甲基氧基）乙炔基、（3-呋喃基甲基氧基）乙炔基、（2-四氫呋喃基甲基氧基）乙炔基、（3-四氫呋喃

基甲基氧基)乙炔基等。

R_1 表示的 $C1\sim C3$ 之烷氧基羰基為烷氧基之烷基係 $C1\sim C3$ 之具有直鏈、分支、或環之烷基。例如乙基氧基羰基等。

R_3 、 R_4 表示的 $C1\sim C3$ 之烷氧基羰基甲基，為烷氧基之烷基係 $C1\sim C3$ 之具有直鏈、或分支、環的烷基。例如甲氧基羰基甲基、乙氧基羰基甲基、*n*-丙基氧基羰基甲基、異丙基氧基羰基甲基、環丙基氧基羰基甲基等。

R_1 表示的 ($C1\sim C3$) 烷基磺醯基 ($C1\sim C3$) 烷基之 ($C1\sim C3$) 烷基磺醯基為具有直鏈、分支、或環之 ($C1\sim C3$) 烷基磺醯基、烯基磺醯基、或炔基磺醯基，($C1\sim C3$) 烷基為具有直鏈、分支、或環之 ($C1\sim C3$) 烷基。例如甲基磺醯基乙基等。

R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_9 表示的 ($C1\sim C4$) 烷基硫基 ($C1\sim C5$) 烷基之 ($C1\sim C4$) 烷基硫基為具有直鏈、分支、或環之 ($C1\sim C4$) 烷基硫基、烯基硫基、或炔基硫基，($C1\sim C5$) 烷基為具有直鏈、分支、或環之 ($C1\sim C5$) 烷基。例如甲基硫基甲基、甲基硫基乙基、乙基硫基甲基、異丙基硫基甲基、三氟甲基硫基甲基等。較佳為甲基硫基甲基、甲基硫基乙基。

R_1 、 R_3 、 R_4 、 R_9 表示的 $C3\sim C12$ 之取代或無取代環烷基為含有 1 個以上之環烷基的 $C3\sim C12$ 之烷基，環上或鏈上烷基部分可含有烯基或炔基。例如環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環丙基甲基、環己基甲基、環戊烯基等。

取代基方面雖未特別限定，例如鹵素原子（氯、溴、氟、碘之任意皆可）或 C1~C3 之烷基。R₁ 較佳為環丙基、環戊基、環己基、更佳為環己基、R₉ 較佳為環丁基、環戊基、環己基等，更佳為環丁基。

R₁、R₃、R₄、R₉ 表示的 3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基為含 1 個~2 個氧原子、硫原子、或氮原子等雜原子之雜環烷基，例如環氧乙基、氮雜環丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、哌嗪基、嗎啉基、氧雜環丁基、硫化三亞甲基、四氫呋喃基、四氫吡喃基等。R₁ 較佳為 2-環氧乙基、3-氮雜環丁烷基、1-嗎啉基、四氫呋喃基，更佳為四氫呋喃基，R₉ 較佳為 3-氧雜環丁基、3-硫化三亞甲基等，更佳為 3-氧雜環丁基等。亦可取代的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基，可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基、C3~C6 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等。

R₁、R₉ 表示的 3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基（C1~C8）烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基（C2~C8）烯基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基（C2~C8）炔基之 3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基為含有 1 個~2 個氧原子、硫原子、或氮原子等雜原子的雜環烷基，例如環氧乙基、氮雜環丁烷基、吡咯烷基、哌啶基、哌嗪基、嗎啉基、氧雜環丁基、硫化三亞甲基、四氫呋喃基、四氫吡喃基等。R₁ 較佳為 3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基（C1~C3）烷基、3 員環~7 員環之

取代或無取代雜環烷基 (C2~C3) 烯基，更佳為 3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C3) 烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C3) 烯基，具體上如嗎啉基甲基、2-(2-四氫呋喃基) 乙基、3-四氫呋喃基甲基，R₉ 較佳為 3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C1~C3) 烷基，更佳為 3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C3) 烷基，具體上如 2-環氧乙基甲基、2-四氫呋喃基甲基、2-四氫吡喃基甲基、3-(2-四氫呋喃基) 丙基、2-(3-四氫呋喃基) 乙基等。亦可取代的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基，可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基、C3~C6 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等。

R₁ 表示的氰 (C1~C3) 烷基之 (C1~C3) 烷基為具有直鏈、分支、或環之 (C1~C3) 烷基。氰 (C1~C3) 烷基之例，可舉例如氰甲基等。

R₁、R₉ 表示的取代或無取代苯氧基 (C1~C8) 烷基、取代或無取代苯氧基 (C2~C8) 烯基、取代或無取代苯氧基 (C2~C8) 炔基之可取代於苯氧基的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基，可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基、C3~C6 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等。取代或無取代苯氧基 (C1~C8) 烷基之 (C1~C8) 烷基、取代或無取代苯氧基 (C2~C8) 烯基之 (C2~C8) 烯基、取代或無取代苯氧基 (C2~C8) 炔基之 (C2~C8) 炔基可具有直鏈、分支、或環。例如苯

氧基甲基、1-苯氧基乙基、2-苯氧基乙基、2-苯氧基乙烯基、2-苯氧基乙炔基、1-苯氧基-1-甲基乙基、1-苯氧基環丙基、2-(3-甲氧基苯氧基)乙基、3-苯氧基-2-丙烯基等，R₁ 較佳為苯氧基甲基。

R₁、R₉ 表示的取代或無取代雜環 (C₁~C₈) 烷基、取代或無取代雜環 (C₂~C₈) 烯基、取代或無取代雜環 (C₂~C₈) 炔基之雜環為具有氧原子、硫原子、或氮原子等雜原子的 3~10 員之芳香族雜環，例如呋喃基、噻吩基、吡啶基、噻啶基、咪啶基、三啶基、吡啶基、嘧啶基、喹啉基等。可取代於雜環的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C₁~C₄ 之烷基，可以鹵素取代的 C₁~C₄ 烷基氧基、C₃~C₆ 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等。取代或無取代雜環 (C₁~C₈) 烷基之 (C₁~C₈) 烷基、取代或無取代雜環 (C₂~C₈) 烯基之 (C₂~C₈) 烯基、取代或無取代雜環 (C₂~C₈) 炔基之 (C₂~C₈) 炔基可具有直鏈、分支、或環。取代或無取代雜環 (C₁~C₈) 烷基、取代或無取代雜環 (C₂~C₈) 烯基、取代或無取代雜環 (C₂~C₈) 炔基之例方面，如 2-呋喃基甲基、2-(2-呋喃基)乙基、2-(3-呋喃基)乙基、1-吡啶基甲基、2-(1-吡啶基)乙基、1-咪啶基甲基、2-咪啶基乙基、2-噻吩基甲基、1-三啶基甲基、2-(4-噻啶基)乙基，R₁ 較佳為取代或無取代雜環 (C₁~C₃) 烷基、取代或無取代雜環 (C₂~C₃) 烯基，更佳為取代或無取代雜環 (C₂~C₃) 烷基，具體上如 2-呋喃基甲基、1-吡啶基甲基、1-咪啶基甲

基、2-噻吩基甲基、1-三唑基甲基，更佳為 1-吡啶基甲基、2-呋喃基甲基、2-噻吩基甲基、2-(3-呋喃基)乙基、2-(2-呋喃基)乙烯基，R₉ 較佳為取代或無取代雜環(C₂~C₃)烷基，具體上為 2-呋喃基、3-吡啶基甲基、4-吡啶基甲基、3-(2-呋喃基)丙基、3-(2-噻吩基)丙基。

R₁、R₉ 表示的取代或無取代雜環氧基(C₁~C₈)烷基、取代或無取代雜環氧基(C₂~C₈)烯基、取代或無取代雜環氧基(C₂~C₈)炔基之雜環為具有氧原子、硫原子、或氮原子等雜原子的 3~10 員之芳香族雜環，例如呋喃基、噻吩基、吡啶基、噻唑基、咪唑基、三唑基、吡啶基、嘧啶基、喹啉基等。可取代於雜環的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C₁~C₄ 之烷基，可以鹵素取代的 C₁~C₄ 烷基氧基、C₃~C₆ 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等。取代或無取代雜環氧基(C₁~C₈)烷基之(C₁~C₈)烷基、取代或無取代雜環氧基(C₂~C₈)烯基之(C₂~C₈)烯基、取代或無取代雜環氧基(C₂~C₈)炔基之(C₂~C₈)炔基可具有直鏈、分支、或環，取代或無取代雜環氧基(C₁~C₈)烷基、取代或無取代雜環氧基(C₂~C₈)烯基、取代或無取代雜環氧基(C₂~C₈)炔基之例方面，如 2-呋喃基氧基甲基、2-(2-呋喃基)氧基乙基、2-(3-呋喃基)氧基乙基、1-吡啶基氧基甲基、2-(1-吡啶基)氧基乙基、1-咪唑基氧基甲基、2-咪唑基氧基乙基、2-噻吩基氧基甲基、1-三唑基氧基甲基、2-(4-噻唑基)氧基乙基。

R_3 、 R_4 表示的取代吡啶基甲基之可取代於吡啶環的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基，可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基、C3~C6 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等。

R_1 表示的取代或無取代之雜環為 5~10 員之雜芳香環，具體例方面，如喹啉環、苯並呋喃環、吲哚環、咪唑啉環、吡啶環、吡嗪環、噻嗪環、嘧啶環、噻吩環、噻唑環、四氫呋喃環、呋喃環等。較佳為、2,6-二氫-3-吡啶基、2,6-二氫-4-吡啶基、2-苯並呋喃基、2-咪唑基、2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-喹啉基、3-噻吩基、4-噻嗪基、5-嘧啶基、3-四氫呋喃基，尤佳為 2-噻吩基、3-噻吩基。

R_1 表示的取代或無取代之芳香環與 C6~C10 芳基同義。

R_1 表示的 (C1~C5) 烷基羰基胺基 (C1~C3) 烷基為具有直鏈、或分支之 (C1~C5) 烷基的羰基胺基 (C1~C3) 烷基，且具體上如甲基羰基胺基乙基等。

R_1 表示的 (C1~C5) 烷基氧基羰基胺基氧基甲基為具有直鏈、或分支之 (C1~C5) 烷基氧基的羰基胺基氧基甲基，具體上，如乙氧基羰基胺基氧基甲基等。

R_1 表示的 (C1~C5) 烷基氧基羰基胺基甲基為具有直鏈、或分支之 (C1~C5) 烷基氧基的羰基胺基甲基，具體上，如 t-丁基氧基羰基胺基甲基等。 R_1 表示的 (C1~C5) 烷基羰基氧基甲基為具有直鏈、或分支之 (C1~C5) 烷

基的羰基氧基甲基，具體上，如甲基羰基氧基甲基等。

R_3 、 R_4 表示的取代或無取代之苯磺醯基之可取代於苯環上的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基，可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基、C3~C6 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等。

R_3 、 R_4 表示的 (C1~C5) 烷基胺基為具有直鏈、或分支之 (C1~C5) 烷基的胺基，具體上，如甲基胺基等。

R_3 、 R_4 表示的取代或無取代苯基胺基之可取代於苯基上的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基，可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基、C3~C6 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等。

R_3 、 R_4 表示的 (C1~C5) 烷基羰基胺基為具有直鏈、或分支之 (C1~C5) 烷基的胺基，具體上，如甲基羰基胺基等。

R_3 、 R_4 表示的取代或無取代苯甲醯基胺基之可取代於苯環上的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基，可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基、C3~C6 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等。

NR_3R_4 形成之環，可舉例如吡啶環、吡咯烷環、哌啶環、嗎啉環等。

在未特別指定下，上述烷基、烯基、炔基可被鹵素原子所取代。

式 (I) 所示之化合物之較佳組合例方面，Ar 為環上可具有取代基的雜環基，X 為硫原子，Y 為 COR_1 或

CO_2R_9 。

Y 為 COR_1 之場合， R_1 為 C1~C4 鹵素化烷基、C2~C6 烯基、C3~C6 炔基、取代或無取代苯基（C1~C4）烷基、取代或無取代苯基（C2~C3）烯基、取代或無取代（C1~C4）烷氧基（C1~C3）烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基（C1~C3）烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基（C1~C3）烯基、取代或無取代雜環（C1~C3）烷基、取代或無取代雜環（C2~C3）烯基，

Y 為 CO_2R_9 之場合， R_9 為 C1~C6 之鹵素化烷基、較佳為 C3~C4 之鹵素化烷基、C3~C6 烯基、較佳為 C5~C6 烯基、C3~C6 炔基、較佳為 C3~C4 炔基、取代或無取代苯基（C1~C4）烷基、取代或無取代苯基（C1~C4）烯基、較佳為取代或無取代苯基（C2~C4）烷基、取代或無取代苯基（C2~C4）烯基、甲氧基（C3~C4）烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基（C1~C3）烷基、較佳為 3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基（C2~C3）烷基、取代或無取代雜環（C2~C3）烷基。）

更佳組合例方面，Ar 為式（II）或式（III）所示之雜環基，X 為硫原子，Y 為 COR_1 或 CO_2R_9 。

Y 為 COR_1 之場合， R_1 為 C1~C3 鹵素化烷基、C4~C6 烯基、C4~C6 炔基、取代苯基（C2~C4）烷基、取代或無取代苯基（C2~C3）烯基、取代或無取代（C1~C4）烷氧基甲基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基（C2~C3）烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基（C2~C3）

) 烯基、取代或無取代雜環 (C2~C3) 烷基、取代或無取代雜環 (C2~C3) 烯基，

Y 為 CO_2R_9 之場合， R_9 為 C3~C4 之鹵素化烷基、C5~C6 烯基、C3~C4 炔基、取代或無取代苯基 (C2~C4) 烷基、取代或無取代苯基 (C2~C4) 烯基、甲氧基 (C3~C4) 烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C3) 烷基、取代或無取代雜環 (C2~C3) 烷基。

本發明之化合物之具體例如表 2~8 所示。

[表2]

化合物編號	Y	X	Ar
2	COCH ₂ CF ₃	S	(II)
3	COCMe ₃	S	(II)
4	COCMe(CF ₃) ₂	S	(II)
5	COCCl ₃	S	(II)
6	CO-phenyl	S	(II)
7	CO-4-chlorophenyl	S	(II)
8	CO-4-methylphenyl	S	(II)
9	CO-cyclohexyl	S	(II)
10	CO-benzyl	S	(II)
11	CO-3-quinoliny	S	(II)
12	CO-3-indolyl	S	(II)
13	CO-3-pyridyl	S	(II)
14	CO-2-pyrazinyl	S	(II)
15	CO-(6-chloro-3-pyridyl)	S	(II)
15	CO-6-Cl-3-Py	S	(II)
16	CO-(5-chloro-2-pyrazinyl)	S	(II)
17	CO-(2,6-dichloro-4-pyridyl)	S	(II)
18	CO-2-pyridazinyl	S	(II)
20	CO-(5-bromo-3-pyridyl)	S	(II)
21	CO-(4-trifluoromethyl-3-pyridyl)	S	(II)
22	CO-(5,6-dichloro-3-pyridyl)	S	(II)
23	CO-(2,6-dichloro-3-pyridyl)	S	(II)
24	CO-(2,3,4,5,6-pentafluorophenyl)	S	(II)
28	CONH ₂	S	(II)
29	CONHMe	S	(II)
32	CONHCOPh	S	(II)
34	CONHCHMe ₂	S	(II)
35	CO-4-morpholinyl	S	(II)
36	CONH-phenyl	S	(II)
37	CONH-cyclohexyl	S	(II)
42	COOMe	S	(II)
43	COOC ₃ H _{7-n}	S	(II)
44	COOC ₃ H _{7-i}	S	(II)
45	COOCH ₂ CH ₂ Cl	S	(II)
46	COOCH ₂ CH ₂ OMe	S	(II)
47	COOCH ₂ -phenyl	S	(II)
48	COO-4-chlorophenyl	S	(II)
49	COO-2-chlorophenyl	S	(II)
51	COO-phenyl	S	(II)
51	COO-phenyl	S	(II)
52	COO-cyclohexyl	S	(II)
53	COO-3-naphtalene	S	(II)
57	COPh	S	(III)
58	CHO	S	(II)
59	CHO	CH ₂	(II)
61	CHO	S	(III)
62	CHO	CH ₂	(III)
63	CO-2-pyrazinyl	CH ₂	(II)
64	CO-(4-trifluoromethyl-3-pyridyl)	CH ₂	(II)
65	CO-2-pyrazinyl	NH	(II)
66	CO-4-trifluoromethyl-3-pyridyl	NH	(II)
67	COCH(CF ₃) ₂	S	(II)
70	CO-6-norboma-2-enyl	S	(II)
71	CO-(1-adamantyl)	S	(II)
72	GOMe	S	(II)
73	COCH ₂ Cl	S	(II)
74	COCHCl ₂	S	(II)
75	COCH ₂ Br	S	(II)
76	COCHF ₂	S	(II)
77	COCClF ₂	S	(II)
78	COCH ₂ OMe	S	(II)
79	COCH ₂ CN	S	(II)
80	COCH ₂ O-phenyl	S	(II)
81	COCH ₂ CH ₂ OMe	S	(II)
82	COCH ₂ NCS	S	(II)
83	COCH=CH ₂	S	(II)

[表3]

化合物編號	Y	X	Ar
84	COCCI=CCI2	S	(II)
85	COCH2CH=CHMe	S	(II)
88	COC(O)2CH2CH3	S	(II)
89	COCH2SMe	S	(II)
90	COCH2CH2SMe	S	(II)
93	CO-2-methylcyclopropyl	S	(II)
94	CO-1-methylcyclopropyl	S	(II)
96	CO-2-furanyl	S	(II)
100	COCH2-3-pyridyl	S	(II)
104	COCH2-1-imidazolyl	S	(II)
106	CONHOMe	S	(II)
107	CONHOEt	S	(II)
110	CONHCH2-2-pyridyl	S	(II)
111	COO-4-methoxyphenyl	S	(II)
111	CONHCH2CH2OMe	S	(II)
113	COOC2H5	S	(II)
113	COOEt	S	(II)
114	COOCH2CH2F	S	(II)
115	COOCH2CHF2	S	(II)
116	COOCH2CF3	S	(II)
117	COOCH2CCl3	S	(II)
119	COOCH2CH2SMe	S	(II)
120	COOCH2CH2SiMe3	S	(II)
121	COOCH2CH2OCH2CF3	S	(II)
122	COOCH2CH2CH2F	S	(II)
123	COOCH(CH2F)2	S	(II)
124	COOCH(Me)CF3	S	(II)
125	COOCH(CF3)2	S	(II)
126	COOCH2CH=CH	S	(II)
127	COOCH2CCI=CCI2	S	(II)
128	COO-n-butyl	S	(II)
129	COOCH2CHMe2	S	(II)
130	COOCH(Me)CH2CH3	S	(II)
131	COO-t-butyl	S	(II)
132	COOCH2CH2CH2CH2F	S	(II)
133	COOCH2CH2CH2CF3	S	(II)
134	COOCH2CF2CF2CF3	S	(II)
135	COOCH2CH=CMe2	S	(II)
139	COO-CH2-cyclopropyl	S	(II)
140	COOCH2-2-oxiranyl	S	(II)
141	COO-cyclobutyl	S	(II)
142	COO-3-oxetanyl	S	(II)
143	COO-cyclopentyl	S	(II)
144	COOCH2-3-tetrahydrofuranyl	S	(II)
145	COOCH2-(2,2-dimethyl-1,3-dioxolan-4-yl)	S	(II)
147	COOCH2-2-tetrahydropyranyl	S	(II)
148	COO-4-nitrophenyl	S	(II)
149	COO-2-methoxyphenyl	S	(II)
150	COOCH2-3-pyridyl	S	(II)
151	COOCH2-4-pyridyl	S	(II)
152	COOCH2-2-furanyl	S	(II)
153	COCH2-3-furanyl	S	(II)
154	COCH2-2-thienyl	S	(II)
155	COCH2-3-thienyl	S	(II)
156	COO-3-pyridyl	S	(II)
163	COO-phenyl	S	(III)
160	COO-iso-propyl	S	(III)
167	COOCHMe2	CH2	(II)
169	COOMe	NH	(II)
170	COOMe	N-Me	(II)
171	COOCH2C≡CH	S	(II)
173	COOCH2CH2CH=CH2	S	(II)
174	CO-(2,4,6-trimethylphenyl)	S	(II)
175	CO-4-biphenyl	S	(II)
176	COCH2tBu	S	(II)
177	CO-(4-t-butylphenyl)	S	(II)

[表4]

化合物編號	Y	X	Ar
178	CO-2-biphenyl	S	(II)
179	CO-2-naphthyl	S	(II)
180	CO-3-naphthyl	S	(II)
181	CO-(2-nitro-3-chlorophenyl)	S	(II)
182	CO-(2-iodophenyl)	S	(II)
183	CO-3-quinoliny	S	(II)
184	COCH ₂ OEt	S	(II)
185	CO-4-fluorophenyl	S	(II)
186	CO-cyclopentyl	S	(II)
187	CO-1-cyclopentenyl	S	(II)
188	CO-3-cyclopentenyl	S	(II)
189	CO(CH ₂) ₁₈ CH ₃	S	(II)
190	CO-CH ₂ -1-pyrazolyl	S	(II)
191	CO-CH ₂ -(4-oxo-2-thioxothiazolidin-3-yl)	S	(II)
192	CO-CH ₂ -rodanina	S	(II)
193	CO-CH ₂ -(3-methyl-5-oxo-1,2,4-oxadiazol-5(4H)-yl)	S	(II)
194	COO-CH ₂ -1-cyclopentyl	S	(II)
195	COO-CH ₂ -3-cyclopentyl	S	(II)
196	COCH(Br)-t-Bu	S	(II)
197	COCH ₂ tBu	S	(III)
198	CO-4-t-butylphenyl	S	(III)
199	CO-3-iodophenyl	S	(II)
200	COO-4-trifluoromethylphenyl	S	(II)
201	COCH ₂ -cyclohexyl	S	(II)
202	CO-3,5-dimethylphenyl	S	(II)
203	CO-2,3-dimethylphenyl	S	(II)
204	COCH(Me)-phenyl	S	(II)
205	COCH(Me)-phenyl	S	(III)
206	COOCH ₂ -2-tetrahydrofuranyl	S	(II)
207	COCH ₂ CH ₂ OEt	S	(II)
208	COOCH ₂ -3-tetrahydrofuranyl	S	(III)
209	COO-3-thietanyl	S	(II)
210	COO-3-thietanyl	S	(III)
211	COO-n-pentyl	S	(II)
212	COOCH ₂ CH ₂ SOOMe	S	(II)
213	CO-2,2-difluorocyclopropyl	S	(II)
214	CONMeOMe	S	(II)
215	CONHOCH ₂ CH=CH ₂	S	(II)
216	COCH ₂ CH ₂ CF ₃	S	(II)
217	COCH ₂ CH ₂ NHCOMe	S	(II)
218	COOCH ₂ CH ₂ OMe	S	(III)
219	COO-3-oxetanyl	S	(III)
220	COOCH ₂ C≡CMe	S	(II)
221	COC≡CMe	S	(II)
222	COCH=CHCH ₃	S	(II)
223	COCH ₂ CH=CH ₂	S	(II)
224	COO-(2,5-dioxopyrrolidin-1-yl)	S	(II)
225	CONHCH ₂ COOEt	S	(II)
226	COO-n-hexyl	S	(II)
227	COOCH ₂ t-Bu	S	(II)
228	COO-CH ₂ -Crownether(18-C-6)	S	(II)
229	COCH ₂ -2-furanyl	S	(II)
230	COCH ₂ OCOMe	S	(II)
231	COCH ₂ -4-morpholiny	S	(II)
232	COCH ₂ -1-(1,2,4-triazolyl)	S	(II)
233	COCH ₂ ONHCOOEt	S	(II)
234	CO-(2-oxo-2H-pyran-5-yl)	S	(II)
235	COCH ₂ -4-imidazolyl	S	(II)
236	COCH ₂ -(2,4-dioxothiazolidin-3-yl)	S	(II)
237	COCH ₂ -(2,5-dioxoimidazolidin-1-yl)	S	(II)
238	COOMe	CH ₂	(II)
239	COCF ₃	NH	(III)
240	COCF ₃	S	(II)
241	COCF ₃	S	(III)
242	CONHCH ₂ -3-pyridyl	S	(II)
243	CONHCH ₂ CH ₂ SMe	S	(II)

[表5]

化合物編號	Y	X	Ar
244	COO-3-methoxyphenyl	S	(II)
245	COCH=CH-phenyl	S	(II)
246	COOCH ₂ CH=CH-phenyl	S	(II)
247	CO-(2-acetoaminophenyl)	S	(II)
248	CO-(2-acetoamino-3-methylphenyl)	S	(II)
249	CO-3-tetrahydrofuranyl	S	(II)
250	COCF ₃	NH	(II)
251	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ NO ₂	S	(II)
252	CO-4-idophenyl	S	(II)
253	CO-C(Me) ₂ -O-(4-chlorophenyl)	S	(II)
254	COOCH ₂ CH ₂ SiMe ₃	S	(II)
255	COOCH ₂ CH ₂ morpholinyl	S	(II)
256	CO-2-methoxyphenyl	S	(II)
257	CO-4-methoxyphenyl	S	(II)
258	CO-3-thienyl	S	(II)
259	CO-2-chlorophenyl	S	(II)
260	CO-2-thienyl	S	(II)
261	CO-4-cyclohexylphenyl	S	(II)
262	CO-2-benzofuranyl	S	(II)
263	CO-C≡C-phenyl	S	(II)
264	CO-3-methoxyphenyl	S	(II)
265	CO-4-ethylphenyl	S	(II)
266	CO-4-oyanophenyl	S	(II)
267	CO-3-methylphenyl	S	(II)
268	CO-2-fluorophenyl	S	(II)
269	CO-3-cyanophenyl	S	(II)
270	CO-2-methylphenyl	S	(II)
271	CO-(2,3-dihydro-1H-indenyl)	S	(II)
272	CO-4-methylsulfonylphenyl	S	(II)
273	CO-3-chlorophenyl	S	(II)
274	COCH ₂ CH(Me) ₂	S	(II)
275	CO-3-nitrophenyl	S	(II)
276	CO-4-nitrophenyl	S	(II)
277	COCH ₂ OCH(Me) ₂	S	(II)
278	CO-[3-(1,2,3,4-tetrahydronaphthalenyl)]	S	(II)
279	CO-CH ₂ O-t-Bu	S	(II)
280	CO-3-fluorophenyl	S	(II)
281	CO-1-phenylcyclopropyl	S	(II)
282	CO-C(Me) ₂ -phenyl	S	(II)
283	CO(CH ₂ CH ₂)-phenyl	S	(II)
284	CO-3-pyrimidinyl	S	(II)
285	COCH ₂ NHCOO-t-Bu	S	(II)
286	CO-2-oxirane	S	(II)
287	CO-3-bromophenyl	S	(II)
288	CO-3-azetydine	S	(II)
289	CO-2-pyridyl	S	(II)
290	CO-4-pyridyl	S	(II)
291	CO-5-chloro-2-thienyl	S	(II)
292	CO-2-fluorophenyl	S	(III)
293	CO-phenyl	NH	(II)
294	CO-2-fluorophenyl	NH	(II)
295	CO-phenyl	S	4CF ₃ -3pyr
296	CO-2-fluorophenyl	S	4CF ₃ -3pyr
297	COO-phenyl	S	4CF ₃ -3pyr
298	CO-2-trifluoromethylphenyl	S	(II)
299	CO-phenyl	S	4,5-dichloro-3pyr
300	CO-phenyl	S	4F-3pyr
301	CO-phenyl	S	4Cl ₅ F ₃ pyr
302	CO-phenyl	S	4Br-3pyr
303	COOCH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(II)
304	COCH ₂ CH ₂ -2-methoxyphenyl	S	(II)
305	COCH ₂ CH ₂ -2-methoxyphenyl	S	(III)
306	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(II)
307	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(II)
308	COCH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(II)
309	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(II)

[表6]

化合物編號	Y	X	Ar
310	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	S	(II)
311	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	S	(III)
312	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(II)
313	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(III)
314	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	S	(II)
315	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	S	(III)
316	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	S	(II)
317	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	S	(III)
318	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	S	(II)
319	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	S	(III)
320	COCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	S	(II)
321	COCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	S	(III)
322	COOCHCH ₂ CF ₃	S	(III)
323	COCH=CH-(3-thienyl)	S	(II)
324	COCH=CH-(4-(2-thienyl)-2-thienyl)	S	(II)
325	COOCH ₂ CH=CH-(3-thienyl)	S	(II)
326	COCH ₂ -(2-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
327	COCH=CH-(2-furanyl)	S	(II)
328	COCH ₂ CH ₂ -(2-thienyl)	S	(II)
329	COOCH ₂ CH ₂ -(2-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
330	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-thienyl)	S	(II)
331	COCH=CH-(2-thienyl)	S	(II)
332	COCH ₂ CH ₂ -(2-furanyl)	S	(II)
333	COCH ₂ CH ₂ CF ₃	S	(II)
334	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	S	(II)
335	COCH ₂ -(3-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
336	COCH ₂ CH ₂ -(2-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
337	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-furanyl)	S	(II)
338	COOCH ₂ CH ₂ -(3-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
339	COCH=CH-(3-furanyl)	S	(II)
340	COO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
341	CO-CH ₂ CH ₂ -(3-furanyl)	S	(II)
342	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	S	(II)
343	COCH ₂ CH ₂ -(4-methoxyphenyl)	S	(II)
344	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	S	(II)
345	COOCH ₂ CH ₂ -(3,5-dimethoxyphenyl)	S	(II)
346	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	S	(II)
347	COOCH ₂ -(3-methoxyphenyl)	S	(II)
348	COOCH ₂ CH ₂ -(3-methoxyphenyl)	S	(II)
349	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-furanyl)	S	(II)
350	COCH ₂ CH ₂ -(3-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
351	COO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
352	COOCH ₂ CH ₂ -(2-thienyl)	S	(II)
353	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl)	S	(II)
354	COOCH ₂ CH ₂ -(3-thienyl)	S	(II)
355	COCH ₂ CH ₂ -(benzo[d][1,3]dioxol-5-yl)	S	(II)
356	COOCH ₂ CH ₂ CF ₃	S	(II)
357	COCH ₂ CH ₂ -(2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl)	S	(II)
358	COCH ₂ CH ₂ -(3-methoxyphenyl)	S	(II)
359	COOCH ₂ CH ₂ -(2-furanyl)	S	(II)
360	COOCH ₂ CH ₂ -(3-furanyl)	S	(II)
361	COCH ₂ Br	S	(II)
362	COCH ₂ I	S	(II)
363	COCHF ₂	S	(II)
364	COCF ₂ Cl	S	(II)
365	COCCl ₃	S	(II)
366	COOCH ₂ -(2-thienyl)	S	(II)
367	COOCH ₂ -(3-thienyl)	S	(II)
368	COCF ₃	NMe	(II)
369	COCF ₃	S	3-tetrahydrofuranyl
370	COCF ₃	NMe	(II)
371	CO-(6-Cl-3-pyridyl)	S	(II)
372	COCH=CHCF ₃	S	(II)
373	COOCH ₂ CH ₂ CN	S	(II)
374	COCH ₂ OCH ₂ C≡CH	S	(II)
375	COCH ₂ CH=CH-(2-furanyl)	S	(II)

[表7]

化合物編號	Y	X	Ar
376	COCH ₂ CH=CH-(2-thienyl)	S	(II)
377	COCH ₂ CH=CH-(3-furanyl)	S	(II)
378	COCH ₂ CH=CH-(3-thienyl)	S	(II)
379	COCH ₂ CH ₂ -(3-thienyl)	S	(II)
380	COCH ₂ CH ₂ CH=CH-(2-furanyl)	S	(II)
381	COCH ₂ CH ₂ CH=CH-(2-thienyl)	S	(II)
382	COCH ₂ CH ₂ CH=CH-(3-furanyl)	S	(II)
383	COCH ₂ CH ₂ CH=CH-(3-thienyl)	S	(II)
384	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-furanyl)	S	(II)
385	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-methoxyphenyl)	S	(II)
386	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
387	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-thienyl)	S	(II)
388	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-furanyl)	S	(II)
389	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-methoxyphenyl)	S	(II)
390	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
391	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-thienyl)	S	(II)
392	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	S	(II)
393	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-furanyl)	S	(II)
394	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
395	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-thienyl)	S	(II)
396	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-furanyl)	S	(II)
397	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
398	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-thienyl)	S	(II)
399	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	S	(II)
400	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	S	(II)
401	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	S	(II)
402	COOCH ₂ CH ₂ CH=CH-(2-furanyl)	S	(II)
403	COOCH ₂ CH ₂ CH=CH-(2-thienyl)	S	(II)
404	COOCH ₂ CH ₂ CH=CH-(3-furanyl)	S	(II)
405	COOCH ₂ CH ₂ CH=CH-(3-thienyl)	S	(II)
406	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-thienyl)	S	(II)
407	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH-(2-furanyl)	S	(II)
408	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH-(2-thienyl)	S	(II)
409	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH-(3-furanyl)	S	(II)
410	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH-(3-thienyl)	S	(II)
411	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-furanyl)	S	(II)
412	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
413	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-thienyl)	S	(II)
414	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-furanyl)	S	(II)
415	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
416	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-thienyl)	S	(II)
417	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	S	(II)
418	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-furanyl)	S	(II)
419	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
420	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-thienyl)	S	(II)
421	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-furanyl)	S	(II)
422	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
423	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-thienyl)	S	(II)
424	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	S	(II)
425	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	S	(II)
426	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	S	(II)
427	COCH ₂ OCH ₂ CH ₂ CF ₃	S	(II)
428	COCH ₂ OCH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(II)
429	COCH ₂ OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	S	(II)
430	COCH ₂ OCH ₂ -(2-furanyl)	S	(II)
431	COCH ₂ OCH ₂ -(3-furanyl)	S	(II)
432	CO-(4-ethynylphenyl)	S	(II)
433	CO-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	S	(II)
434	CO-CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	S	(II)
435	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-methoxyphenyl)	S	(II)
436	CO-CH ₂ OCH ₂ -(2-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
437	CO-CH ₂ OCH ₂ -(3-tetrahydrofuranyl)	S	(II)
438	CO-CH ₂ OCH ₂ -(2-thienyl)	S	(II)
439	CO-CH ₂ OCH ₂ -(3-thienyl)	S	(II)
440	CO-CH ₂ OCH ₂ -phenyl	S	(II)
441	CO-CH ₂ OCH ₂ -(2-fluorophenyl)	S	(II)

[表8]

化合物編號	Y	X	Ar
442	CO-CH ₂ OCH ₂ -(3-fluorophenyl)	S	(II)
443	CO-CH ₂ OCH ₂ -(2-methoxyphenyl)	S	(II)
444	CO-CH ₂ OCH ₂ -(3-methoxyphenyl)	S	(II)
445	CO-CH ₂ OCH ₂ -(2-trifluoromethoxyphenyl)	S	(II)
446	CO-CH ₂ CH ₂ -(2-fluorophenyl)	S	(II)
447	CO-CH ₂ CH ₂ -(3-fluorophenyl)	S	(II)

式 (Ia) 中的 R₁' 表示的可取代於取代苯基 (C₂~C₄) 烷基的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C₁~C₄ 之烷基，可以鹵素取代的 C₁~C₄ 烷基氧基、C₃~C₆ 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等，且在相鄰碳取代的取代基可一起為 -O-(CH₂)_n-O- (在此 n 為 1 或 2)。較佳取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C₁~C₄ 之烷基，可以鹵素取代的 C₁~C₄ 烷基氧基所選出的基，且在相鄰碳取代的取代基可一起為 -O-(CH₂)_n-O- (在此 n 為 1 或 2)。更佳為甲氧基、或在相鄰碳取代的取代基可一起為 -O-(CH₂)_n-O- (在此 n 為 1 或 2)。

可取代於 R₁' 表示的 3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C₂~C₃) 烷基的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C₁~C₄ 之烷基，可以鹵素取代的 C₁~C₄ 烷基氧基、C₃~C₆ 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等，

可取代於 R₁' 表示的取代或無取代雜環 (C₂~C₃) 烷基的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C₁~C₄ 之烷基，可以鹵素取代的 C₁~C₄ 烷基氧基、C₃~C₆ 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等，

可取代於 R₁' 表示的取代或無取代 (C₁~C₄) 烷氧基

甲基的取代基方面，如鹵素原子、C3~C6 之環狀烷基、苯基、3 員環~7 員環的雜環烷基、取代或無取代雜環等，較佳為鹵素原子、3 員環~7 員環的雜環烷基、雜環等。苯基可被鹵素原子，可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基，可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基、C3~C6 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基所取代，且在相鄰碳取代的取代基可一起為 -O-(CH₂)_n-O-（在此 n 為 1 或 2）。雜環烷基可被鹵素取代。又，雜環可被鹵素取代。

可取代於 R₉' 表示的取代或無取代苯基（C2~C4）烷基的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基，可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基、C3~C6 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等，較佳為鹵素原子，可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基，可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基。且在相鄰碳取代的取代基可一起為 -O-(CH₂)_n-O-（在此 n 為 1 或 2），

可取代於 R₉' 表示的 3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基（C2~C3）烷基的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基，可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基、C3~C6 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等，

可取代於 R₉' 表示的取代或無取代雜環（C2~C3）烷基的取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C1~C4 之烷基，可以鹵素取代的 C1~C4 烷基氧基、C3~C6 之環狀烷基、甲基磺醯基、甲氧基、硝基、氰基等。

式 (Ia) 所示之化合物之較佳組合例方面，Ar' 爲式 (II) 或式 (III) 所示之雜環基，X' 爲硫原子，Y' 爲 COR₁'、或 CO₂R₉'。

Y 爲 COR₁' 之場合，R₁' 爲取代苯基 (C₂~C₄) 烷基、3 員環~7 員環的無取代雜環烷基 (C₂~C₃) 烷基、無取代雜環 (C₂~C₃) 烷基、取代或無取代 (C₁~C₄) 烷氧基甲基，

Y' 爲 CO₂R₉' 之場合，R₉' 爲取代或無取代苯基 (C₂~C₄) 烷基、3 員環~7 員環的無取代雜環烷基 (C₂~C₃) 烷基、無取代雜環 (C₂~C₃) 烷基，

式 (Ia) 所示之化合物之更佳組合例方面，

Ar' 爲式 (II) 或式 (III) 所示之雜環基，X' 爲硫原子，Y' 爲 COR₁'、或 CO₂R₉'。

Y 爲 COR₁' 之場合，R₁' 爲苯基乙基 (在此，苯基爲被 1~2 個之甲氧基取代者、或在相鄰碳取代的取代基可一起爲 -O-(CH₂)_n-O- (在此 n 爲 1 或 2))、四氫呋喃基 (C₂~C₃) 烷基、呋喃基 (C₂~C₃) 烷基、噻吩基 (C₂~C₃) 烷基、呋喃基甲基氧基甲基、鹵素化 (C₁~4) 烷基氧基甲基，

Y' 爲 CO₂R₉' 之場合，R₉' 爲取代或無取代苯基 (C₂~C₄) 烷基 (在此，亦可取代之取代基方面，如鹵素原子、可以鹵素取代的 C₁~C₄ 之烷基，可以鹵素取代的 C₁~C₄ 烷基氧基，且在相鄰碳取代的取代基可一起爲 -O-(CH₂)_n-O- (在此 n 爲 1 或 2))、3 員環~7 員環的無取

代雜環烷基 (C₂~C₃) 烷基、無取代雜環 (C₂~C₃) 烷基

本發明之有害生物防除劑包含的化學式 (I) 所示之化合物可以國際公開 2010-001922 號公報 (專利文獻 3) 記載之方法得到。

適用本發明之有害生物防除劑之動物寄生性害蟲方面，如蜱類 (例如美洲花蜱、墨西哥灣蜱、微小牛蜱、洛磯山革蜱、西海岸蜱、美洲狗蜱、何氏血蜱、褐黃血蜱、長角血蜱、巨棘血蜱、達內家達硬蜱 (*xodes nipponensis*)、卵形硬蜱、西部太平洋硬蜱、全溝硬蜱、篋麻硬蜱、太平洋硬蜱、家斯其硬蜱、棕色犬壁蝨)、肉食蟎類 (例如貓蟎、狗蟎)、毛囊蟲類 (例如狗毛囊蟲、貓毛囊蟲)、怪蟎類 (例如牛怪蟎)、疥蟲類 (例如牛痒蟎、耳疥蟲)、巨刺蟎類 (例如雞疥癬)、雞皮刺蟎類、尾葉羽蟎類 (例如雞羽蜱、雞翼羽蜱)、恙蟎類 (例如合輪恙蟎、紅纖恙蟎)、跳蚤類 (例如貓蚤、人蚤)、蝨子類 (例如狗蝨、雞蝨)、蝨目類 (例如豬蝨、狗蝨、體蝨、頭蝨、陰蝨)、蠅類 (例如牛蠅、廐刺蠅)、虻類、吸蟲類、鉤蟲類、條蟲類、線蟲類、原蟲類、孢子蟲類等。較佳為動物寄生性的跳蚤類、蜱類，更佳為動物寄生性的蜱類。適用本發明之有害生物防除劑的衛生害蟲、不愉快害蟲、儲穀害蟲、儲藏食品害蟲、及居家害蟲方面，如蚊類 (例如白線斑蚊、淡色庫蚊)、蟑螂類 (黑褐家蠊、大和蜚蠊、德國姬蠊)、疥蟎類 (例如腐食酪蟎)、蠅類 (例如家蠅、

肉蠅、蛾蚋類、果蠅、搖蚊類)、蚋類、蠓類、膜翅目昆蟲(例如日本弓背蟻、火蟻等蟻類、中華大虎頭蜂等蜂類)、鼠婦目的節足動物(例如鼠婦、海蟑螂、卷甲蟲)、半翅目昆蟲(例如溫帶臭蟲)、多足亞門節足動物(例如蜈蚣類、蚰蜒類、馬陸類)、蜘蛛目的節足動物(例如白額高腳蛛)、鞘翅目昆蟲(例如步行蟲)、跳蟲目節足動物(例如白跳蟲)、革翅目昆蟲(例如日本蠹蝨)、直翅目昆蟲(例如竈馬)、甲蟲目昆蟲(例如豆象、玉米象、大穀盜、擬穀盜、蛛甲、食骸蟲、小蠹蟲、鏗節蟲、王冠綠虎天牛、鱗翅目昆蟲(例如螟蛾類、衣蛾類)、扁蟲類、白蟻目昆蟲(例如家白蟻、小楹白蟻、黑翅土白蟻)、纓尾目(例如絨毛衣魚)等。

本發明之有害生物防除劑除化學式(I)所示之化合物外，亦可混合既存藥劑來調製。

本發明之有害生物防除劑除化學式(I)所示之化合物外，亦可使用因應使用法的載體來調製。

可使用的載體，可舉例如液體載體、固體載體、氣體狀載體、界面活性劑、分散劑、其他製劑用補助劑等。

固體載體，可舉例如黏土類(卡力歐黏土、矽藻土、膨土、酸性白土等)、合成含氫氧化矽、滑石、陶瓷、其他無機礦物(亞硒酸鹽、石英、硫、活性碳、碳酸鈣、水合二氧化矽等)等微粉末或粒狀物、澱粉、乳糖、纖維素、氯化乙烯基系聚合物、聚胺基甲酸酯等合成聚合物、食物及動物飼料(飼料用粕、油粕、穀類粉、穀類粗粉等)

。液體載體，可舉例如醇類（甲醇、乙醇、異丙醇、聚乙二醇、丙二醇、二丙二醇、三丙二醇、甘油等）、酮類（丙酮、甲基乙基酮等）、芳香族烴類（苧基醇、苯、甲苯、二甲苯、乙基苯、甲基萘等）、脂肪族烴類（液態石蠟、n-己烷、環己烷、煤油、燈油等）、醚類（二乙二醇單乙基醚、二乙二醇單甲基醚、二異丙基醚、二乙基醚、二噁烷、四氫呋喃等）、酯類（碳酸伸丙酯、乙酸乙酯、乙酸丁酯、安息香酸苧酯、肉豆蔻酸異丙酯、丙二醇之脂肪酸酯等）、腈類（乙醯腈、異正丁腈等）、醯胺類（二甲基甲醯胺、二甲基乙醯胺、N-甲基吡咯烷酮等）、鹵素化烴類（二氯甲烷、三氯乙烷、四氯化碳等）、大豆油、綿實油等動植物油類、二甲基亞砷、矽酮油、高級脂肪酸、甘油縮甲醛、水等。

氣體狀載體，可舉例如 LPG、空氣、氮、碳酸氣體、二甲基醚等。

爲了乳化、分散、展著等之界面活性劑、分散劑，可舉例如烷基硫酸酯類、烷基（芳基）磺酸鹽類、聚氧化伸烷基烷基（芳基）醚類、多元醇酯類、木質素磺酸鹽等。

進而爲改善製劑性狀之補助劑，可舉例如羧基甲基纖維素、阿拉伯膠、聚乙二醇、硬脂酸鈣等。

上述載體、界面活性劑、分散劑、及補助劑因應必要可各自單獨或組合使用。

本發明之有害生物防除劑可以液劑、水合劑、乳劑、

粒劑、顆粒水合劑、液化滴劑（spot-on 劑、pour-on 劑）、噴霧劑、泡狀製劑、氣溶膠劑、錠劑、顆粒劑、細粒劑、粉劑、膠囊劑、嚼錠劑、注射劑、塞劑、乳霜劑、洗髮劑、洗滌劑、樹脂劑、燻煙劑、毒餌劑等多樣劑型提供。

本發明之有害生物防除劑係動物寄生性害蟲的防除劑時，以液劑、乳劑、液化滴劑（spot-on 劑、pour-on 劑）、噴霧劑、泡狀製劑、氣溶膠劑、錠劑、顆粒劑、細粒劑、粉劑、膠囊劑、嚼錠劑、注射劑、塞劑、乳霜劑、洗髮劑、洗滌劑、樹脂劑、燻煙劑、毒餌劑等為佳、液劑、液化滴劑（spot-on 劑、pour-on 劑）特別佳。

在液劑中，進一步亦可搭配一般乳化劑、分散劑、展著劑、濕潤劑、懸濁化劑、安定化劑、保存劑、噴射劑等製劑用補助劑等，進一步，亦可搭配一般塗膜形成劑。用於乳化、分散、展著等的界面活性劑，可舉例如皂類、聚氧化伸烷基烷基（芳基）醚類、聚氧化伸乙基烷基烯丙基醚類、聚氧化伸乙基脂肪酸酯、高級醇類、烷基芳基磺酸酯等。分散劑，可舉例如酪蛋白、明膠、多糖類、木質素衍生物、糖類、合成水溶性高分子等。展著、濕潤劑，可舉例如甘油、聚乙二醇等。懸濁化劑，可舉例如酪蛋白、明膠、羥基丙基纖維素、阿拉伯膠等，安定化劑，可舉例如酚系抗氧化劑（BHT、BHA 等）、胺系抗氧化劑（二苯基胺等）、有機硫系抗氧化劑等。保存劑，可舉例如羥苯甲酸甲酯、羥苯甲酸乙酯、羥苯甲酸丙酯、羥苯甲酸丁酯等。上述載體、界面活性劑、分散劑、及補助劑因應必要

，可各自單獨或組合使用。進而亦可含有香料、共力劑等。本發明之有害生物防除劑中的有效成分之含量在液劑時通常為 1-75 重量%。

液化滴劑（spot-on 劑、pour-on 劑）為可使本發明之有效成分於可塗佈皮膚之液體載體，例如醇類、液態石蠟等脂肪族烴類、丙二醇之脂肪酸酯等酯類、動植物油類、水等溶解、懸濁、或乳化因應必要添加吸收促進劑、著色劑、保存劑等來調劑。

錠劑、顆粒劑、細粒劑、粉劑、膠囊劑、嚼錠劑可藉由將本發明之有效成分適當地分成小分，與澱粉、乳糖等賦形劑混合，因應必要加入纖維素般崩散劑、阿拉伯膠、羥基丙基纖維素等結合劑、硬脂酸鎂、滑石等潤滑劑，因應劑型進行打錠、成型、造粒、整粒、膠囊充填來調劑。本發明之有害生物防除劑中的有效成分之含量通常以 0.1~50 重量%為合適。

調製注射劑用載體方面，需要做成無菌溶液的調製，但於其中亦可含有其他物質，例如使該溶液與血液成等張用的充分量鹽或葡萄糖。可使用的載體方面，如甘油酯、安息香酸苄酯、肉豆蔻酸異丙酯及丙二醇之脂肪酸衍生物等之酯、N-甲基吡咯烷酮、甘油縮甲醛般有機溶劑。本發明之有害生物防除劑中的有效成分之含量在注射劑通常以 0.01-10 重量%為合適。

調製乳霜劑所使用之載體，可舉例如非揮發性烴類（流動液態石蠟等）、氫化羊毛脂類、高級脂肪酸、脂肪酸

酯、動植物油、矽酮油、水等，進一步，乳化劑、保濕劑、抗氧化劑、香料、硼砂、紫外線吸收劑亦因應必要可各自單獨或組合使用。乳化劑，可舉例如脂肪酸山梨糖醇酐、聚氧化伸乙基烷基醚、脂肪酸聚氧化伸乙酯等。本發明之有害生物防除劑中的有效成分之含量在乳霜劑通常以 0.5-70 重量%為合適。

調製樹脂劑用之載體，可舉例如氯化乙烯基系聚合物、聚胺基甲酸酯等。在此等基材，因應必要可添加苯二甲酸酯類、己二酸酯類、硬脂酸等可塑劑。在該基材中混合本有效成分後以射出成型、押出成型、加壓成型等進行成型。進而亦可經過適當成型、裁斷等步驟做成動物用耳標、動物用防蟲頸圈。

毒餌劑用之載體，可舉例如食物、動物飼料及誘引物質（小麥粉、玉米粉等穀粉、玉米澱粉、馬鈴薯澱粉等澱粉、結晶糖、麥芽糖、蜂蜜等糖類、甘油、洋蔥香料、牛奶香料等食品香料、蛹粉、魚粉等動物性粉末、各種費落蒙）等。本發明之有害生物防除劑之有效成分之含量在毒餌劑通常以 0.0001-90 重量%為合適。

本發明之有害生物防除劑可藉由經口或注射投與適用動物之體內、投與適用動物之體表的全體或部分、被覆害蟲的預想侵入、寄生、移動場所進行有害生物防除。

本發明之有害生物防除劑雖可直接使用，因情況可在水、液狀之載體、市售洗髮精、洗滌劑、餌、飼育屋舍地板等稀釋後使用。

【實施方式】

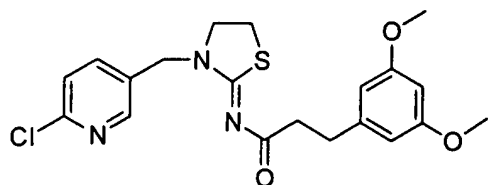
[實施例]

以下舉實施例將本發明具體說明，但本發明不限於此等之實施例。

[合成例]

合成例 1：化合物編號 345

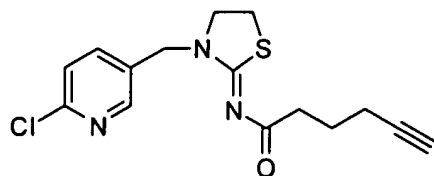
【化7】



將以 *Journal of Medicinal Chemistry* 42 (12), 2227, (1999) 記載之方法合成的 3-(2-氯-5-吡啶基甲基)-2-亞胺基噻唑啉 114mg (0.50mmol)、1-乙基-3-(3-二甲基胺基丙基)碳二醯亞胺鹽酸鹽 (EDC-HCl) 96mg (0.50mmol)、4-二甲基胺基吡啶 (DMAP) 65mg (0.53mmol) 溶於無水二氯甲烷 3ml，加入 3-(3,5-二甲氧基苯基)丙酸 105mg (0.50mmol)，在室溫進行一晚攪拌。反應完畢後，使反應液以二氯甲烷稀釋，依序以 1% NaOH aq.、1% HCl aq.洗淨後，以無水硫酸鎂進行乾燥，餾去溶劑。將其以分離用薄層層析板 (0.5mm 板 2 片、己烷：乙酸乙酯=1：1 進行 2 次展開) 進行精製而得到目的物。收量 134mg (收率 63%)。

合成例 2：化合物編號 309

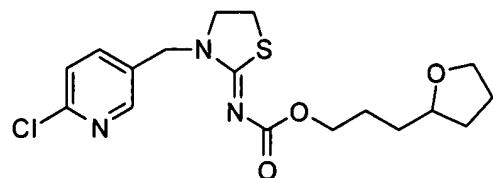
【化8】



將 5-己炔酸 15mg (0.13mmol) 溶於無水二氯甲烷 3ml，依序添加 3-(2-氯-5-吡啶基甲基)-2-亞胺基噻唑啉 30mg (0.13mmol)、EDC-HCl 29mg (0.15mmol)、DMAP 20mg (0.16mmol)，在室溫進行 1 小時攪拌。反應完畢後，使反應液以二氯甲烷稀釋，依序以 1% NaOH aq.、1% HCl aq.洗淨後，以無水硫酸鎂進行乾燥，餾去溶劑。將其以分離用薄層層析板 (0.5mm 板 1 片、乙酸乙酯 100%進行展開) 進行精製而得到目的物。收量 16mg (收率 40%)。

合成例 3：化合物編號 340

【化9】



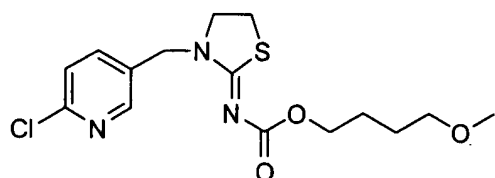
將 3-(四氫呋喃-2-基)丙烷-1-醇 104mg (0.80mmol) 溶於無水二氯甲烷 10ml，依序添加三乙基胺 132 μ l (96mg, 0.96mmol)、氯甲酸 4-硝基苯酯 190mg (0.80mmol)

)，在室溫進行 1 小時攪拌。反應完畢後，使反應液以二氯甲烷稀釋，以 1% HCl aq. 洗淨後，以無水硫酸鎂乾燥、進行減壓濃縮、以二氧化矽膠體管柱層析法 (己烷：乙酸乙酯 = 1：4) 進行精製得到 4-硝基苯基 3-(四氫呋喃-2-基)丙基碳酸酯 54mg (收率 34%)。

另外，將 3-(2-氯-5-吡啶基甲基)-2-亞胺基噻唑啉 28mg (0.12mmol) 溶於無水乙醯腴 7ml，依序加入以前述的方法得到的 4-硝基苯基 3-(四氫呋喃-2-基)丙基碳酸酯 36mg (0.12mmol)、碳酸鉀 20mg (0.14mmol)，在 60°C 進行 6 小時攪拌。反應完畢後，使不溶物以矽藻土進行吸附過濾而除去，使濾液減壓濃縮後，溶於乙酸乙酯後依序以 1% NaOH aq., 1% HCl aq. 洗淨。以無水硫酸鎂乾燥後減壓濃縮，以分離用 TLC 板 (0.5mm 片、己烷：乙酸乙酯 = 1：3 進行展開) 進行精製而得到目的物。收量 16mg (收率 35%)。

合成例 4：化合物編號 346

【化10】



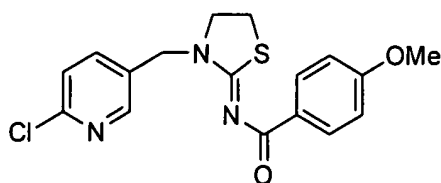
使 4-甲氧基丁烷-1-醇 92mg (0.88mmol) 溶於無水二氯甲烷 1.0ml，加入三乙基胺 122 μ l (89mg, 0.88mmol)，在 0°C 進行 30 分鐘攪拌。於其中，使氯甲酸 4-硝基苯

酯 161mg (0.80mmol) 溶於無水二氯甲烷 2ml 後加入，在室溫進行 1 日攪拌。反應完畢後，使反應液注入水 25ml，以氯仿進行 3 次萃取。使有機層以飽和小蘇打水進行 2 次、以飽和食鹽水進行 1 次洗淨後，以無水硫酸鈉乾燥，餾去溶劑而得到 4-甲氧基丁基 4-硝基苯基碳酸酯 188mg (收率 79%)。

使得到的 4-甲氧基丁基 4-硝基苯基碳酸酯 148mg (0.50mmol) 溶於無水乙醯腴 7ml，依序加入 3-(2-氯-5-吡啶基甲基)-2-亞胺基噻唑啉 114mg (0.50mmol)、碳酸鉀 80mg (0.58mmol)，在 50℃ 進行 14 小時、在室溫進行 90 小時攪拌。反應完畢後，將反應液注入 30ml 水，並以乙酸乙酯進行 2 次萃取。將乙酸乙酯層以水、飽和食鹽水每 1 次洗淨後，以無水硫酸鈉乾燥、減壓濃縮後得到組成物 222mg。將此 163mg 以分離用薄層層析板 (0.25mm 板 2 片、己烷：乙酸乙酯=1：1 進行展開) 精製得到目的物 102mg (收率 78%)。

合成例 5：化合物編號 257

【化 11】

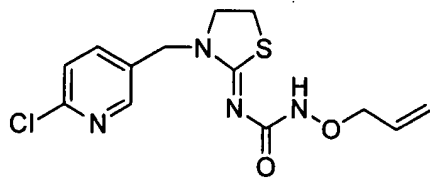


使 3-(2-氯-5-吡啶基甲基)-2-亞胺基噻唑啉 100mg (0.44mmol) 溶於無水乙醯腴 10ml，依序添加三乙基胺

87 μ l (61mg, 0.57mmol) 、 4-甲氧基苯甲醯基氯化物 82mg (0.48mmol) ， 在室溫進行一晚攪拌。反應完畢後，使乙醯腈減壓餾去，加入甲醇則結晶析出。濾取結晶，以甲醇充分洗滌，使乾燥而得到目的物。收量 112mg (收率 71%) 。

合成例 6：化合物編號 215

【化12】



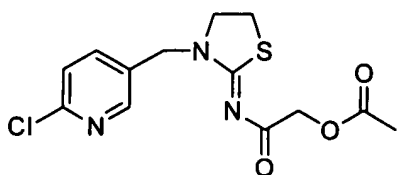
使 3- (2-氯-5-吡啶基甲基) -2-亞胺基噻唑啉 486mg (2.0mmol) 溶解於乙醯腈 15ml，加入三乙基胺 260mg (2.5mmol) ，使氯甲酸 4-硝基苯酯 406mg (2.0mmol) 溶於二氯甲烷 5ml 者在冰冷下滴下，進行 10 小時加熱迴流。反應完畢後，使乙醯腈減壓餾去，加入 1% HCl aq. 與乙酸乙酯，濾取得到的結晶。濾液依序以 1% HCl aq.、水、飽和小蘇打水、水洗淨，以無水硫酸鎂乾燥後使乙酸乙酯餾去，加入醚則結晶析出，濾取並與前述的結晶合一，而得到 (Z) -4-硝基苯基 3- ((6-氯吡啶-3-基) 甲基) 噻唑啉-2-亞基胺基甲酸酯。收量 624mg (收率 82%) 。

使以前述的方法得到的 (Z) -4-硝基苯基 3- ((6-氯吡啶-3-基) 甲基) 噻唑啉-2-亞基胺基甲酸酯 395mg (1mmol) 與乙酸鈉 164mg (2.0mmol) 溶於乙醯腈 20ml，

邊在冰冷下攪拌邊使 O-烯丙基羥基胺鹽酸鹽以乙醯脲溶解者滴下，進行 3 小時加熱迴流。反應完畢後，使溶劑減壓餾去，使殘渣溶於乙酸乙酯後以 1% HCl aq.、水、飽和小蘇打水、水洗淨後，以無水硫酸鎂乾燥、減壓濃縮後結晶析出，將之濾取。收量 203mg (收率 65%)。

合成例 7：化合物編號 230

【化13】



使 3-(2-氯-5-吡啶基甲基)-2-亞胺基噻唑啉 400mg (1.76mmol) 溶於無水乙醯脲 20ml，加入三乙基胺 290 μ l (2.11mmol、2.11mg)，在冰冷下加入溴乙醯基氯化物 152 μ l (1.76mmol、354mg)，在室溫進行一晚攪拌。反應完畢後，使反應液減壓濃縮，將殘渣溶於二氯甲烷，以 1% NaOH aq.、1% HCl aq. 洗淨後，以無水硫酸鎂進行乾燥、濃縮，以二氧化矽膠體管柱層析法 (己烷：乙酸乙酯=2:3) 精製得到 (Z)-2-溴-N-(3-((6-氯吡啶-3-基)甲基)噻唑啉-2-亞基)乙醯胺。收量 321mg (收率 53%)。

將以前述的方法得到的 (Z)-2-溴-N-(3-((6-氯吡啶-3-基)甲基)噻唑啉-2-亞基)乙醯胺 66mg (0.19mmol) 溶於無水乙醯脲 2ml，加入乙酸鉀 20mg (0.22mmol)

、四丁基銨溴化物 32mg (0.10mmol) 進行 13 小時加熱迴流。反應完畢後，使溶劑減壓餾去而結晶化。加入氯仿濾取收集不溶物，而得到目的物。再將濾液以水洗淨後，以無水硫酸鎂乾燥、進行減壓濃縮、加入己烷結晶化後濾取收集，與前述的結晶合一。收量 43mg (收率 66%)。

同樣地，合成表 2~表 8 之化合物。其合成結果與物性值一併記載於表 9~19。

[表9]

化合物編號	原料1	原料2	合成例	NMR (CDCl ₃ , δ, ppm)	IR (KBr, v. cm ⁻¹) or MS
4	HOOC-C(Me)(CF ₃) ₂	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.70 (3H, m), 3.22 (2H, t), 3.67 (2H, t), 4.84 (2H, s), 7.35 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	1640, 1542
7	(4-chlorophenyl)-COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.20 (2H, t), 3.63 (2H, t), 4.97 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.38 (2H, d), 7.69 (1H, dd), 8.19 (2H, d), 8.39 (1H, d)	m/z=368 (M+H)
8	HOOC-(4-methylphenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.41 (3H, s), 3.18 (2H, t), 3.60 (2H, t), 4.97 (2H, s), 7.22 (2H, d), 7.31 (1H, d), 7.72 (1H, d), 8.15 (2H, dd), 8.39 (1H, d)	m/z=348 (M+H)
15	HOOC-(6-chloro-3-pyridyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.23 (2H, t), 3.67 (2H, t), 4.96 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.39 (1H, d), 7.67 (1H, dd), 8.40 (2H, m), 9.22 (1H, d)	1628 (C=O)
18	(2-pyridazinyl)-COOH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.27 (2H, t), 3.71 (2H, t), 5.00 (2H, s), 7.35 (1H, d), 7.67 (1H, dd), 8.13 (1H, dd), 8.39 (1H, d), 9.38 (1H, dd), 9.87 (1H, d)	m/z=334 (M+H)
20	(3-bromo-5-pyridyl)-COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.24 (2H, t), 3.67 (2H, t), 4.98 (2H, s), 7.34 (1H, d), 7.67 (1H, dd), 8.38 (1H, s), 8.59 (1H, s), 8.78 (1H, s), 9.35 (1H, s)	1624 (C=O)
46	ClCOOCH ₂ CH ₂ OMe	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.17 (2H, t), 3.43 (3H, s), 3.55 (2H, t), 3.68 (2H, t), 4.32 (2H, t), 4.84 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.68 (1H, dd), 8.30 (1H, d)	1657 (C=O)
53	HO-3-naphthalene	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	3.23 (2H, t), 3.74 (2H, t), 4.80 (2H, s), 7.30 (1H, d), 7.35 (1H, m), 7.48 (2H, m), 7.61 (1H, m), 7.69 (1H, m), 7.86 (2H, m), 8.37 (1H, s)	1664, 1546
65	(2-pyrazinyl)-COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.48 (2H, t), 3.78 (2H, t), 4.73 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.72 (1H, d), 8.38 (1H, s), 8.64 (1H, d), 8.70 (1H, d), 8.91 (1H, s), 9.52 (1H, s)	1628, 1806
73	ClCH ₂ COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.18 (2H, t), 3.62 (2H, t), 4.22 (2H, s), 4.82 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.69 (1H, dd), 8.35 (1H, d)	m/z=304 (M+H)
75	BrCOGH ₂ Br	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.18 (2H, t), 3.62 (2H, t), 4.02 (2H, s), 4.83 (2H, s), 7.35 (1H, d), 7.72 (1H, dd), 8.36 (1H, d)	1540, 1532
76	CHF ₂ COOH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.23 (2H, t), 3.68 (2H, t), 4.87 (2H, s), 5.94 (1H, t), 7.34 (1H, d), 7.70 (1H, d), 8.38 (1H, s)	1564, 1548
78	MeOCH ₂ COOH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.15 (2H, t), 3.48 (3H, s), 3.57 (2H, t), 4.17 (2H, s), 4.80 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	m/z=300 (M+H)
104	BrCOCH ₂ Br, imidazole	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	3.17 (2H, t), 3.60 (2H, t), 4.68 (2H, s), 4.78 (2H, s), 6.98 (1H, s), 7.08 (1H, s), 7.52 (1H, d), 7.42 (1H, dd), 7.53 (1H, s), 8.28 (1H, d)	1728, 1636, 1536
111	MeOCH ₂ CH ₂ NH ₂	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	6	3.09 (2H, t), 3.37 (2H, s), 3.47 (4H, m), 3.50 (2H, t), 4.71 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.62 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	1607, 1578, 1531
113	EtOCOCI	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	1.38 (3H, t), 3.18 (2H, t), 3.83 (2H, t), 4.24 (2H, q), 4.86 (2H, s), 7.40 (1H, s)	1664, 1552, 1529
117	CCl ₃ CH ₂ COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.21 (2H, t), 3.63 (2H, t), 4.84 (2H, s), 4.85 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.67 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	1668, 1536
124	HO-CH(Me)CF ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.45, 1.46 (3H, s), 3.18 (2H, t), 3.61 (2H, t), 4.81 (1H, d), 4.85 (1H, d), 5.31 (1H, m), 7.33 (1H, d), 7.66 (1H, d), 8.32 (1H, d)	1668, 1543
128	CH ₃ (CH ₂) ₃ COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	0.88 (3H, t), 1.44 (2H, m), 1.72 (2H, m), 3.17 (2H, t), 3.27 (2H, t), 4.18 (2H, t), 4.66 (2H, s), 7.48 (1H, s)	1661, 1550, 1528
128	HO-CH ₂ CHMe ₂	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	0.96 (6H, d), 2.04 (1H, m), 3.15 (2H, t), 3.56 (2H, t), 3.95 (2H, d), 4.82 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.66 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	1658, 1550
131	t-BuOH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.52 (9H, s), 3.12 (2H, t), 3.51 (2H, t), 4.81 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.63 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	1653, 1560
134	HO-CH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	3.21 (2H, t), 3.64 (2H, t), 4.68 (2H, m), 4.82 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.67 (1H, d), 8.33 (1H, d)	1681, 1552
139	HO-CH ₂ -cyclopropyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	0.32 (2H, m), 0.58 (2H, m), 1.24 (1H, m), 3.18 (2H, t), 3.56 (2H, t), 4.00 (2H, d), 4.81 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.65 (1H, d), 8.32 (1H, s)	1662, 1550

[表10]

化合物編號	原料1	原料2	合成例	NMR (CDCl ₃ , δ, ppm)	IR (KBr, v. cm ⁻¹) or MS
140	HO-CH ₂ -2-oxiranyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	2.68 (1H, dd), 2.84 (1H, dd), 3.18 (2H, t), 3.30 (1H, m), 3.81 (2H, t), 4.11 (1H, dd), 4.37 (1H, dd), 4.81 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.77 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	1666, 1550
141	HO-cyclobutyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.81 (1H, m), 1.80 (1H, m), 2.19 (2H, m), 2.39 (2H, m), 3.15 (2H, t), 3.56 (2H, t), 4.82 (2H, s), 5.02 (1H, m), 7.32 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	1664, 1548
143	ClCOO-cyclopentyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	1.51 (1.97 (8H, m), 3.14 (2H, t), 3.54 (2H, t), 4.81 (2H, s), 5.15 (1H, m), 7.32 (1H, d), 7.63 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	1850, 1546
144	HO-CH ₂ -3-tetrahydrofuranlyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.65 (1H, m), 2.08 (1H, m), 2.69 (1H, m), 3.17 (2H, t), 3.56 (2H, t), 3.61 (1H, m), 3.76 (1H, m), 4.08 (1H, m), 4.17 (1H, m), 7.33 (1H, d), 7.84 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	1665, 1550
147	HO-CH ₂ -2-tetrahydropyranlyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.30-1.92 (6H, m), 3.15 (2H, t), 3.44 (1H, t), 3.55 (2H, t), 3.60 (1H, m), 3.95 (1H, m), 4.23 (2H, d), 4.82 (2H, s), 7.35 (1H, d), 7.66 (1H, dd), 8.30 (1H, d)	1661, 1543
153	HOOC-CH ₂ -3-furanlyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	3.16 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.79 (2H, s), 5.07 (2H, s), 6.50 (1H, s), 7.30 (1H, d), 7.38 (1H, d), 7.52 (1H, s), 7.93 (1H, dd), 8.30 (1H, d)	1657, 1557
154	HOOC-CH ₂ -2-furyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.11 (2H, t), 3.55 (2H, t), 3.98 (2H, s), 4.78 (2H, s), 6.93 (2H, m), 7.17 (1H, dd), 7.28 (1H, m), 7.53 (1H, dd), 8.29 (1H, d)	m/z=352 (M+H)
155	HOOC-CH ₂ -3-thienyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.11 (2H, t), 3.54 (2H, t), 3.81 (2H, s), 4.75 (2H, s), 7.07 (1H, dd), 7.23 (1H, d), 7.25 (2H, m), 7.47 (1H, dd), 8.27 (1H, d)	m/z=352 (M+H)
156	(3-pyridyl)-OH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	3.23 (2H, t), 3.67 (2H, t), 4.84 (2H, s), 7.30-7.37 (2H, m), 7.58 (1H, dd), 7.87 (1H, dd), 8.34 (1H, d), 8.45 (1H, dd), 8.53 (1H, d)	1682, 1548
160	CH(Me)2COCl	3-(2-chloro-5-thiazolylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	1.33 (6H, d), 3.18 (2H, t), 3.62 (2H, t), 4.87 (2H, s), 5.03 (1H, sept), 7.45 (1H, s)	1667, 1550, 1530
163	PhCOCl	3-(2-chloro-5-thiazolylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.21 (2H, t), 3.69 (2H, t), 4.89 (2H, s), 7.19 (7.47 (6H, m)	
167	HO-CHMe2	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminopyrrolidine	3.4	1.31 (6H, d), 2.04 (2H, m), 3.10 (2H, t), 3.32 (2H, t), 4.69 (2H, s), 4.94 (1H, sept), 7.30 (1H, d), 7.62 (1H, d), 8.30 (1H, d)	1671, 1567
171	HO-CH2C≡CH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	2.47 (1H, t), 3.19 (2H, t), 3.61 (2H, t), 4.76 (2H, d), 4.81 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.87 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	1658, 1550
174	(2,4,6-trimethylphenyl)-COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	2.27 (9H, s), 3.18 (2H, t), 3.59 (2H, t), 4.81 (2H, s), 6.83 (2H, s), 7.28 (1H, d), 7.59 (1H, dd), 8.29 (1H, d)	
175	4-diphenyl-COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.19 (2H, t), 3.63 (2H, t), 4.89 (2H, s), 7.30-7.50 (4H, m), 7.65 (4H, m), 7.73 (1H, dd), 8.32 (2H, d), 8.40 (1H, d)	1620, 1526, 1407, 1278
176	tBuCH2COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	1.05 (9H, s), 2.40 (2H, s), 3.11 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.80 (2H, s), 7.30 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	1625, 1518, 1458, 1400
177	HOOC-(4-t-butylphenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	1.34 (9H, s), 3.17 (2H, t), 3.81 (2H, t), 4.90 (2H, s), 7.30 (1H, d), 7.45 (2H, d), 7.72 (1H, dd), 8.19 (2H, d), 8.40 (1H, d)	1621, 1529, 1404, 1286
178	HOOC-2-diphenyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.04 (2H, t), 3.38 (2H, t), 4.13 (2H, s), 7.17-7.50 (10H, m), 7.95 (1H, d), 8.08 (1H, c)	1621, 1528, 1404
179	HOOC-1-naphthyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.25 (2H, t), 3.75 (2H, t), 4.93 (2H, s), 7.52 (4H, m), 7.81 (1H, dd), 7.95 (1H, dd), 8.05 (1H, d), 8.27 (1H, d), 8.43 (1H, d), 8.89 (1H, m)	1525, 1402, 1238
180	HOOC-2-naphthyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.21 (2H, t), 3.64 (2H, t), 5.04 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.51 (1H, dd), 7.9 (1H, dd), 7.78 (1H, dd), 7.87 (2H, d), 7.98 (1H, d), 8.30 (1H, dd), 8.44 (1H, d), 8.82 (1H, s)	1615, 1526, 1402
181	(2-nitro-3-chlorophenyl)-COOH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.28 (2H, t), 3.74 (2H, t), 4.90 (2H, s), 7.45 (1H, d), 7.66 (1H, dd), 7.77 (1H, dd), 7.81 (1H, d), 8.17 (1H, d), 8.41 (1H, s)	1623, 1545, 1524, 1398
182	(2-iodophenyl)-COOH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.15 (2H, t), 3.62 (2H, t), 4.90 (2H, s), 7.07 (1H, dd), 7.32 (1H, d), 7.38 (1H, dd), 7.67 (1H, dd), 7.89 (1H, d), 7.95 (1H, d), 8.36 (1H, d)	1620, 1523, 1404
183	(3-quinolinyl)-COOH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.26 (2H, t), 3.81 (2H, t), 5.08 (2H, s), 7.49 (1H, d), 7.60 (1H, dd), 7.85 (1H, dd), 7.90 (1H, dd), 8.23 (1H, s), 8.51 (1H, d), 9.04 (1H, d), 9.53 (1H, d)	1626, 1614, 1588, 1523, 1456, 1399

[表11]

化合物編號	原料1	原料2	合成例	NMR (CDCl ₃ , δ, ppm)	IR (KBr, v, cm ⁻¹) or MS
184	HOOC-CH ₂ OEt	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.27 (3H, t), 3.15 (2H, t), 3.58 (2H, t), 3.63 (2H, q), 4.21 (2H, s), 4.80 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	1648, 1587
185	HOOC-4-fluorophenyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.19 (2H, t), 3.62 (2H, t), 4.98 (2H, s), 7.07-7.27 (2H, m), 7.33 (1H, d), 7.70 (1H, dd), 8.28 (2H, m), 8.40 (1H, d)	1622, 1523
186	HOOC-cyclopentyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.58 (2H, m), 1.71 (2H, m), 1.82-1.94 (4H, m), 2.90 (1H, m), 3.12 (2H, t), 3.55 (2H, t), 4.84 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.68 (1H, dd), 8.38 (1H, d)	1626, 1568
187	HOOC-1-cyclopentyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.97 (2H, t), 2.52 (2H, m), 2.64 (2H, m), 3.12 (2H, t), 3.53 (2H, t), 4.84 (2H, s), 6.90 (1H, m), 7.31 (1H, d), 7.67 (1H, dd), 8.37 (1H, d)	1633, 1600, 1632
188	HOOC-3-cyclopentyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.61-2.77 (4H, m), 3.12 (2H, t), 3.28 (1H, m), 3.56 (2H, t), 4.81 (2H, s), 5.67 (2H, m), 7.31 (1H, d), 7.68 (1H, dd), 8.35 (1H, d)	1632, 1527
189	CH ₃ (CH ₂) ₁₁ COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	0.87 (3H, t), 1.24 (28H, m), 1.68 (2H, m), 2.47 (2H, t), 3.10 (2H, t), 3.50 (2H, t), 4.80 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	2918, 2849, 1529, 1399
190	BrCOCH ₂ Br, pyrazole	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1	3.14 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.68 (2H, s), 5.03 (2H, s), 6.30 (1H, t), 7.30 (1H, d), 7.52 (3H, m), 8.25 (1H, d)	1647, 1534
191	BrCOCH ₂ Br, rodanine	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	3.18 (2H, t), 3.62 (2H, t), 3.98 (2H, s), 4.35 (2H, s), 4.82 (2H, s), 7.36 (1H, d), 7.68 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	
192	BrCOCH ₂ Br, rodanine	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	3.19 (2H, t), 3.63 (2H, t), 3.98 (2H, s), 4.35 (2H, s), 4.82 (2H, s), 7.36 (1H, d), 7.69 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	1728, 1708, 1626, 1542
193	BrCOCH ₂ Br, 3-methyl-1,2,4-oxiazolin-5-on potassium salt	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	2.20 (3H, s), 3.21 (2H, t), 3.65 (2H, t), 4.39 (2H, s), 4.76 (2H, s), 7.35 (1H, d), 7.59 (1H, dd), 8.29 (1H, d)	1772, 1641, 1545
194	HO-CH ₂ -1-cyclopentyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.91 (2H, t), 2.34 (2H, m), 3.17 (2H, t), 3.58 (2H, t), 4.73 (2H, s), 4.82 (2H, s), 5.71 (1H, m), 7.32 (1H, d), 7.6 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	1546
195	HO-CH ₂ -3-cyclopentyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	2.15 (2H, m), 2.53 (2H, m), 2.73 (1H, m), 3.16 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.08 (2H, s), 4.85 (2H, s), 5.65 (2H, m), 7.33 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	1654, 1550
196	tBuCH ₂ (Br)COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	1.20 (9H, s), 3.16 (2H, td), 3.61 (2H, t), 4.34 (1H, s), 4.70 (1H, d), 4.80 (1H, d), 7.32 (1H, d), 7.73 (1H, dd), 8.36 (1H, d)	1627, 1526, 1408
197	tBuCH ₂ COCl	3-(2-chloro-5-thiazolylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	1.08 (9H, s), 2.44 (2H, s), 3.12 (2H, t), 3.58 (2H, t), 4.83 (2H, s), 7.47 (1H, s)	1627, 1513, 1399, 1231
198	(4-t-butylphenyl)-COOH	3-(2-chloro-5-thiazolylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.34 (9H, s), 3.16 (2H, t), 3.68 (2H, t), 4.99 (2H, s), 7.47 (1H, s), 7.49 (2H, d), 8.24 (2H, d)	1618, 1520, 1408
199	(3-iodophenyl)-COOH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.19 (2H, t), 3.63 (2H, t), 4.99 (2H, s), 7.17 (1H, dd), 7.33 (1H, d), 7.68 (1H, dd), 7.82 (1H, d), 8.20 (1H, d), 8.39 (1H, s), 8.58 (1H, d)	2360, 1618, 1527, 1417
201	cyclohexyl-CH ₂ COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	0.90-1.31 (4H, m), 1.60-1.76 (4H, m), 1.90 (1H, m), 2.35 (2H, d), 3.12 (2H, t), 3.51 (2H, t), 4.80 (2H, s), 7.30 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	2923, 1632, 1526, 1460, 1403
202	(3,5-dimethylphenyl)-COOH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.38 (6H, d), 3.15 (2H, t), 3.59 (2H, t), 4.96 (2H, s), 7.14 (1H, s), 7.30 (1H, d), 7.70 (1H, dd), 7.86 (2H, s), 8.38 (1H, d)	1526, 1430
203	(2,3-dimethylphenyl)-COOH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.32 (3H, s), 2.56 (3H, s), 3.17 (2H, t), 3.59 (2H, t), 4.89 (2H, s), 7.11 (1H, dd), 7.23 (1H, d), 7.30 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 7.70 (1H, d), 8.35 (1H, d)	1623, 1524, 1457, 1457, 1401
204	phenyl-CH(Me)-COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	1.56 (3H, d), 3.08 (2H, m), 3.48 (2H, m), 3.85 (1H, s), 4.51 (1H, d), 4.82 (1H, d), 7.09 (1H, d), 7.20-7.38 (6H, m), 8.20 (1H, d)	1634, 1530, 1457, 1401
205	phenyl-CH(Me)-COCl	3-(2-chloro-5-thiazolylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	1.64 (3H, d), 3.08 (2H, m), 3.49 (2H, m), 3.85 (1H, s), 4.51 (1H, d), 4.82 (1H, d), 7.45 (1H, s)	1634, 1530, 1458, 1401
206	HO-CH ₂ -2-tetrahydrofuryl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.65 (1H, m), 1.85-2.05 (3H, m), 3.16 (2H, t), 3.57 (2H, t), 3.78 (1H, dd), 3.89 (1H, dd), 4.10-4.23 (3H, m), 4.80 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.68 (1H, dd), 8.30 (1H, d)	1657, 1549

[表12]

化合物編號	原料1	原料2	合成例	NMR (CDCl ₃ , δ ppm)	IR (KBr. v. cm ⁻¹) or MS
207	HOOC-CH ₂ CH ₂ OEt	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	1.19 (3H, t), 2.78 (2H, t), 3.12 (2H, t), 3.53 (4H, m), 3.78 (2H, t), 4.81 (2H, t), 7.31 (1H, d), 7.66 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	
208	HO-CH ₂ -3-tetrahydrofuryl	3-(2-chloro-5-thiazolymethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	1.71 (2H, m), 2.07 (1H, m), 2.71 (1H, m), 3.18 (2H, t), 3.64 (2H, t), 3.78 (1H, m), 3.89 (2H, m), 4.10 (1H, dd), 4.20 (1H, dd), 4.86 (2H, s), 7.46 (1H, s)	1661, 1549, 1527
209	HO-3-thietanyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	3.17 (2H, t), 3.34 (2H, m), 3.59 (4H, m), 3.64 (1H, m), 7.33 (1H, d), 7.63 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	
210	HO-3-thietanyl	3-(2-chloro-5-thiazolymethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	3.19 (2H, t), 3.36 (2H, t), 3.65 (4H, m), 4.86 (2H, s), 5.64 (1H, m), 7.46 (1H, s)	
211	ClCOO-n-pentyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	0.90 (3H, t), 1.36 (4H, m), 1.73 (2H, m), 3.15 (2H, t), 3.58 (2H, t), 4.16 (2H, t), 4.81 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	1660, 1561
212	HO-CH ₂ CH ₂ SOOMe	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	3.01 (3H, s), 3.20 (2H, t), 3.39 (2H, t), 3.61 (2H, t), 4.56 (2H, t), 4.78 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.62 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	
213	HOOC-2,2-difluorocyclopropyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	1.68 (1H, m), 2.13 (1H, m), 2.64 (1H, m), 3.15 (2H, t), 3.61 (2H, t), 4.74 (1H, d), 4.91 (1H, d), 7.35 (1H, d), 7.70 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	
214	(CH ₃ ONHCH ₃)-HCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	6	3.14 (2H, t), 3.29 (3H, s), 3.57 (2H, t), 3.73 (3H, s), 4.77 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.66 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	
215	(H ₂ NOCH ₂ CH=CH ₂)-HCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	6	3.14 (2H, t), 3.54 (2H, t), 4.43 (2H, d), 4.71 (2H, s), 5.28 (1H, d), 5.34 (1H, d), 5.99 (1H, m), 7.31 (1H, d), 7.61 (1H, dd), 8.30 (1H, d)	
216	HOOC-CH ₂ CH ₂ CF ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	2.49 (2H, m), 2.72 (2H, m), 3.15 (2H, m), 3.62 (2H, m), 4.84 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.67 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	
217	HOOC-CH ₂ CH ₂ NHCOCH ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	1.94 (3H, s), 2.71 (2H, t), 3.16 (2H, t), 3.54 (2H, t), 3.56 (2H, t), 4.61 (2H, s), 6.30 (1H, br s), 7.33 (1H, d), 7.63 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	
218	HO-CH ₂ CH ₂ OMe	3-(2-chloro-5-thiazolymethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	2.80 (2H, t), 3.13 (2H, t), 3.38 (3H, s), 3.62 (2H, t), 3.77 (2H, t), 4.85 (2H, s), 7.46 (1H, s)	
219	HO-3-oxetanyl	3-(2-chloro-5-thiazolymethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	3.28 (2H, t), 3.76 (2H, t), 4.65 (2H, m), 4.90 (2H, s), 5.04 (2H, m), 5.22 (1H, m), 7.54 (1H, s)	
220	HO-CH ₂ C≡CMe	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	1.85 (3H, t), 3.17 (2H, t), 3.58 (2H, t), 4.73 (2H, t), 4.81 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.66 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	
221	HOOC-C≡C-CH ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	2.00 (3H, s), 3.18 (2H, t), 3.61 (2H, t), 4.85 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.68 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	
222	HOOC-CH=CH-CH ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	1.89 (3H, d), 3.12 (2H, t), 3.56 (2H, t), 4.84 (2H, s), 6.13 (1H, m), 7.06 (1H, m), 7.31 (1H, d), 7.66 (1H, dd), 8.35 (1H, d)	
223	HOOC-CH ₂ CH=CH ₂	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	1.89 (2H, dd), 3.12 (2H, t), 3.26 (1H, m), 3.58 (2H, t), 4.66 (2H, s), 5.08 (1H, m), 7.07 (1H, m), 7.35 (1H, d), 7.71 (1H, dd), 8.36 (1H, d)	
224	HO-1-pyrrolidinyl-2,5-dione	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	2.76 (4H, s), 3.35 (2H, t), 3.82 (2H, t), 4.81 (2H, s), 7.52 (1H, d), 7.79 (1H, d), 8.39 (1H, d) DMSO-d ₆	1731, 1552
225	EtOOCCH ₂ NCO	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	another methods	1.23 (3H, t), 3.08 (2H, m), 3.57 (2H, m), 3.82 (2H, s), 4.10 (2H, m), 4.74 (2H, s), 7.37 (1H, m), 7.77 (1H, m), 8.41 (1H, m)	1742, 1610, 1578, 1531
226	HO-(CH ₂) ₅ CH ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	0.89 (3H, t), 1.31 (6H, m), 1.40 (2H, m), 1.71 (2H, m), 3.15 (2H, t), 3.56 (2H, t), 4.16 (2H, t), 4.81 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	1724, 1657, 1552
227	HO-CH ₂ tBu	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	0.98 (9H, s), 3.15 (2H, t), 3.56 (2H, t), 3.90 (2H, s), 4.82 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.66 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	1661, 1546
228	HO-CH ₂ -Crownether(18-C-6)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	3.16 (2H, t), 3.57 (2H, t), 3.70 (2H, m), 3.85 (2H, m), 4.23 (2H, dd), 4.80 (2H, dd), 7.32 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	1663, 1550
229	HOOC-CH ₂ -2-furyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	3.12 (2H, t), 3.56 (2H, t), 3.83 (2H, s), 4.73 (2H, s), 6.20 (1H, d), 6.33 (1H, d), 7.27 (1H, d), 7.34 (1H, d), 7.55 (1H, dd), 8.28 (1H, d)	

[表13]

化合物編號	原料1	原料2	合成例	NMR (CDCl ₃ , δ, ppm)	IR (KBr, ν, cm ⁻¹) or MS
230	BrCOCH ₂ Br, CH ₃ COOK	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	2.17 (3H s), 3.18 (2H t), 3.57 (2H t), 4.78 (2H s), 4.79 (2H s), 7.33 (1H d), 7.83 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	1744, 1660, 1537, 1417
231	BrCOCH ₂ Br, morpholine	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	2.62 (4H m), 3.14 (2H t), 3.37 (2H s), 3.58 (2H t), 3.77 (4H t), 4.80 (2H s), 7.32 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	1730, 1646, 1531, 1460, 1409
232	BrCOCH ₂ Br, 1,2,4-triazole	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	3.18 (2H t), 3.60 (2H t), 4.68 (2H s), 5.07 (2H s), 7.32 (1H, d), 7.50 (1H, dd), 7.95 (1H, s), 8.21 (1H, d), 8.27 (1H, d)	1632, 1534
233	BrCOCH ₂ Br, HONHCOOEt	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	1.26 (3H t), 3.19 (2H t), 3.60 (2H t), 4.20 (2H q), 4.50 (2H s), 4.80 (2H s), 7.33 (1H, d), 7.61 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	1733, 1707, 1647, 1596, 1534
234	HOOC-5-(2H-pyran-2-yl)-one	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.22 (2H t), 3.64 (2H t), 4.89 (2H s), 6.32 (1H, d), 7.34 (1H, d), 7.61 (1H, dd), 8.02 (1H, d), 8.38 (1H, s), 8.51 (1H, s)	1730, 1638, 1528
235	BrCOCH ₂ Br, imidazole·HCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	3.12 (2H t), 3.56 (2H t), 3.83 (2H t), 4.77 (2H s), 6.92 (sH, d), 7.30 (1H, m), 7.57 (2H m), 8.29 (1H, d)	1621, 1530
236	BrCOCH ₂ Br, thiazolidinedione	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	3.18 (2H t), 3.58 (2H t), 4.00 (2H s), 4.47 (2H s), 4.79 (2H s), 7.38 (1H, d), 7.63 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	1748, 1683, 1644, 1537
237	BrCOCH ₂ Br, imidazolidine-2,4-dione	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	3.18 (2H t), 3.88 (2H t), 3.96 (2H t), 4.11 (2H s), 4.78 (2H s), 7.52 (1H, d), 7.60 (1H, dd), 8.09 (1H, s), 8.40 (1H, d) DMSO-d ₆	1713, 1529
242	H ₂ N-CH ₂ -(3-pyridyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	8	3.11 (2H t), 3.61 (2H t), 4.82 (2H s), 4.70 (2H s), 7.19-7.31 (3H, m), 7.60 (1H, dd), 7.70 (1H, d), 8.31 (1H, d), 8.50 (1H, d), 8.56 (1H, s)	1626, 1524
243	H ₂ N-CH ₂ CH ₂ SMe	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	8	2.13 (3H s), 2.89 (2H t), 3.10 (2H t), 3.49 (4H m), 4.78 (2H s), 5.61 (br s), 7.30 (1H, d), 7.61 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	1605, 1577, 1521, 1507
245	HOOC-CH=CH-phenyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.14 (2H t), 3.58 (2H t), 4.90 (2H s), 6.73 (1H, d), 7.35 (4H, m), 7.58 (2H, m), 7.70 (1H, dd), 7.79 (1H, d), 8.38 (1H, d)	1637, 1593, 1529
246	HO-CH ₂ CH=CH-phenyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	3.17 (2H t), 3.57 (2H t), 4.81 (2H s), 4.84 (2H d), 6.39 (1H, m), 6.78 (1H, d), 7.20-7.41 (6H, m), 7.66 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	1669, 1654, 1546
247	1H-benzo[d][1,3]oxazin-4(2H)-one	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	another methods	2.28 (3H s), 3.22 (2H t), 3.65 (2H t), 4.96 (2H s), 7.05 (1H, m), 7.32 (1H, d), 7.49 (1H, td), 7.69 (1H, dd), 8.38 (1H, d), 8.43 (1H, dd), 8.70 (1H, d)	1682, 1592, 1517, 1460, 1395
248	8-methyl-1H-benzo[d][1,3]oxazin-4(2H)-one	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	another methods	2.22 (3H s), 2.34 (3H s), 3.19 (2H t), 3.62 (2H t), 4.91 (2H s), 7.13 (1H, m), 7.34 (2H m), 7.68 (1H, dd), 8.08 (1H, d), 8.34 (1H, d)	1532, 1460, 1407
249	HOOC-3-tetrahydroxyaryl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	2.14 (1H, m), 2.28 (1H, m), 3.15 (2H t), 3.25 (1H, m), 3.58 (2H t), 3.80-4.05 (4H, m), 4.82 (2H, d x 2), 7.33 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	1628, 1529, 1411
251	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ NO ₂	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	2.42 (2H, m), 3.18 (2H t), 3.59 (2H t), 4.28 (2H t), 4.54 (2H t), 4.80 (2H s), 7.35 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	
252	(4-iodophenyl)-COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.18 (2H t), 3.61 (2H t), 4.94 (2H s), 7.31 (1H, d), 7.66 (1H, dd), 7.75 (2H, d), 7.98 (2H, d), 8.37 (1H, d)	1530, 1405, 1278
253	(4-chlorophenyl)-O-C(Me) ₂ -COOH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	1.57 (6H s), 3.14 (2H t), 3.55 (2H t), 4.68 (2H s), 6.70 (2H, d), 7.08 (1H, d), 7.17 (3H, m), 8.21 (1H, s)	1635, 1530, 1489, 1463, 1402
254	HO-CH ₂ CH ₂ SiMe ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	0.05 (9H s), 1.09 (2H t), 3.13 (2H t), 3.54 (2H t), 4.24 (2H t), 4.79 (2H s), 7.30 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.30 (1H, d)	2951, 1665, 1541
255	HO-CH ₂ CH ₂ morpholinyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	2.65 (4H, m), 2.78 (2H t), 3.15 (2H t), 3.58 (2H t), 3.74 (4H, m), 4.29 (2H t), 4.78 (2H s), 7.28 (1H, d), 7.62 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	1705, 1550, 1459
256	(2-methoxyphenyl)-COOH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.18 (2H t), 3.58 (2H t), 3.91 (3H s), 4.91 (2H s), 6.97 (2H, m), 7.31 (1H, d), 7.42 (1H, td), 7.72 (1H, dd), 8.00 (1H, dd), 8.38 (1H, d)	m/z=367 (M+H)
257	(4-methoxyphenyl)-COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.17 (2H t), 3.60 (2H t), 3.66 (3H s), 4.96 (2H s), 6.91 (2H, d), 7.31 (1H, d), 7.71 (1H, dd), 8.22 (2H, d), 8.40 (1H, d)	m/z=362 (M+H)
258	HOOC-3-thienyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.17 (2H t), 3.60 (2H t), 4.92 (2H s), 7.27 (1H, m), 7.33 (1H, d), 7.84 (1H, d), 7.70 (1H, dd), 8.21 (1H, d), 8.38 (1H, d)	m/z=338 (M+H)

[表14]

化合物編號	原料1	原料2	合成例	NMR (CDCl ₃ , δ, ppm)	IR (KBr, v, cm ⁻¹) or MS
259	(2-chlorophenyl)-COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.21 (2H, t), 3.62 (2H, t), 4.91 (2H, s), 7.26 - 7.36 (3H, m), 7.42 (1H, d), 7.89 (1H, dd), 7.93 (1H, dd), 8.39 (1H, d)	m/z=366 (M+H)
260	2-thienyl-COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.18 (2H, t), 3.83 (2H, t), 4.90 (2H, s), 7.10 (1H, m), 7.31 (1H, d), 7.49 (1H, m), 7.76 (1H, dd), 7.88 (1H, dd), 8.41 (1H, d)	m/z=366 (M+H)
261	HOOC-(4-cyclohexyl)Ph	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.20-1.32 (1H, m), 1.36-1.48 (4H, m), 1.75 (1H, m), 1.83-1.89 (4H, m), 2.56 (1H, m), 3.17 (2H, t), 3.60 (2H, t), 4.97 (2H, s), 7.25 (2H, d), 7.31 (1H, d), 7.72 (1H, dd), 8.18 (2H, d), 8.39 (1H, d)	m/z=338 (M+H)
262	HOOC-2-benzofuranyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.22 (2H, t), 3.65 (2H, t), 4.97 (2H, s), 7.27 (2H, d), 7.34 (1H, d), 7.41 (1H, td), 7.60 (1H, m), 7.66 (1H, d), 7.77 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	m/z=414 (M+H)
263	HOOC C≡C Ph	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.18 (2H, t), 3.81 (2H, t), 4.90 (2H, s), 7.33-7.42 (4H, m), 7.80 (2H, m), 7.72 (1H, dd), 8.36 (1H, d)	m/z=356 (M+H)
264	HOOC (3-methoxyphenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.19 (2H, t), 3.62 (2H, t), 3.85 (3H, s), 4.97 (2H, s), 7.06 (1H, dd), 7.26-7.35 (2H, m), 7.72 (1H, dd), 7.83 (1H, m), 7.89 (1H, d), 8.39 (1H, d)	m/z=362 (M+H)
265	HOOC-(4-ethylphenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.28 (2H, t), 2.70 (2H, t), 3.18 (2H, t), 3.60 (2H, t), 4.97 (2H, s), 7.25 (2H, d), 7.32 (1H, d), 7.18 (1H, dd), 8.18 (2H, d), 8.40 (1H, d)	m/z=360 (M+H)
266	HOOC-(4-cyanophenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.23 (2H, t), 3.66 (2H, t), 4.98 (2H, s), 7.34 (1H, d), 7.66 (1H, dd), 7.72 (2H, d), 8.33 (2H, d), 8.40 (1H, d)	m/z=357 (M+H)
267	HOOC-(3-methylphenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.40 (3H, s), 3.18 (2H, t), 3.61 (2H, t), 4.98 (2H, s), 7.32 (3H, m), 7.72 (1H, dd), 8.07 (2H, m), 8.40 (1H, d)	m/z=346 (M+H)
268	HOOC-(2-fluorophenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.19 (2H, t), 3.62 (2H, t), 4.92 (2H, s), 7.11 (1H, dd), 7.17 (1H, m), 7.31 (1H, d), 7.45 (1H, m), 7.73 (1H, dd), 8.10 (1H, td), 8.39 (1H, d)	m/z=350 (M+H)
269	HOOC-(3-cyanophenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	7.23 (2H, t), 7.66 (2H, t), 5.00 (2H, s), 7.35 (1H, d), 7.56 (1H, t), 7.67 (1H, dd), 7.77 (1H, d), 8.39 (1H, d), 8.45 (1H, d), 8.56 (1H, s)	m/z=357 (M+H)
270	(2-methylphenyl)-COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	2.67 (3H, s), 3.18 (2H, t), 3.59 (2H, t), 4.92 (2H, s), 7.22 (2H, m), 7.33 (2H, m), 7.68 (1H, dd), 8.12 (1H, d), 8.37 (1H, d)	m/z=346 (M+H)
271	HOOC-(2,3-dihydro-1H-indenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.12 (2H, t), 3.23 (2H, dd), 3.32 (2H, dd), 3.48 (1H, m), 3.57 (2H, t), 4.77 (2H, s), 7.12 (2H, m), 7.19 (2H, m), 7.27 (1H, d), 7.53 (1H, d), 8.33 (1H, d)	m/z=372 (M+H)
272	HOOC-(4-SDMe-phenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.23 (2H, t), 3.67 (2H, t), 4.99 (2H, s), 7.34 (1H, dd), 7.67 (1H, dd), 8.00 (2H, dd), 8.41 (2H, dd), 8.43 (1H, d)	m/z=410 (M+H)
273	HOOC-(3-chlorophenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.20 (2H, t), 3.63 (2H, t), 4.98 (2H, s), 7.35 (2H, dd), 7.48 (1H, dd), 7.70 (1H, dd), 8.11 (1H, dd), 8.23 (1H, t), 8.40 (1H, d)	m/z=366 (M+H)
274	HOOCCH ₂ CH(Me) ₂	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	0.95 (6H, d), 2.20 (1H, m), 2.38 (2H, d), 3.11 (2H, t), 3.53 (2H, t), 4.80 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.63 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	m/z=312 (M+H)
275	HOOC (3-nitrophenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.24 (2H, t), 3.69 (2H, t), 5.01 (2H, s), 7.35 (1H, d), 7.82 (1H, m), 7.71 (1H, dd), 8.36 (1H, dd), 8.41 (1H, d), 8.55 (1H, d), 9.08 (1H, d)	m/z=377 (M+H)
276	(4-nitrophenyl)-OCOCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.24 (2H, t), 3.67 (2H, t), 5.00 (2H, s), 7.34 (1H, d), 7.88 (1H, dd), 8.28 (2H, dd), 8.39 (3H, m)	m/z=377 (M+H)
277	HOOC-CH ₂ OCH(Me) ₂	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.15 (2H, t), 3.57 (2H, t), 3.74 (1H, sept), 4.22 (2H, s), 4.81 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	m/z=328 (M+H)
278	HOOC-[3-(1,2,3,4-tetrahydronaphthalenyl)]	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.91 (1H, m), 2.24 (1H, m), 2.88 (3H, m), 3.06 (2H, m), 3.13 (2H, t), 3.55 (2H, t), 4.81 (2H, d), 7.06 (4H, m), 7.30 (1H, d), 7.59 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	m/z=386 (M+H)
279	HOOC-CH ₂ O(Bu)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.26 (9H, s), 3.13 (2H, t), 3.55 (2H, t), 4.17 (2H, s), 4.79 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.67 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	m/z=342 (M+H)
280	HOOC-(3-fluorophenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.20 (2H, t), 3.63 (2H, t), 4.97 (2H, s), 7.20 (1H, td), 7.34 (1H, d), 7.40 (1H, m), 7.70 (1H, dd), 7.83 (1H, dd), 8.04 (1H, dd), 8.40 (1H, d)	m/z=350 (M+H)

[表15]

化合物編號	原料1	原料2	合成例	NMR (CDCl ₃ , δ ppm)	IR (KBr, ν, cm ⁻¹); or MS
281	HOOC-C(cyclopropyl)-Ph	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	1.21 (2H, t), 1.68 (2H, t), 3.08 (2H, t), 3.52 (2H, t), 4.47 (2H, s), 7.17 (3H, m), 7.12-7.78 (4H, m), 7.44 (2H, m), 8.11 (1H, d)	m/z=372 (M+H)
282	HOOC-C(Me) ₂ -Ph	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	1.62 (6H, s), 3.08 (2H, t), 3.50 (2H, t), 4.57 (2H, s), 7.00 (2H, m), 7.19-7.37 (4H, m), 8.12 (1H, d)	m/z=374 (M+H)
283	HOOC-(CH ₂ CH ₂)-Ph	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	2.82 (2H, t), 3.02 (2H, t), 3.11 (2H, t), 3.52 (2H, t), 4.78 (2H, s), 7.16-7.32 (5H, m), 7.57 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	m/z=360 (M+H)
284	HOOC-3-pyridinyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.25 (2H, t), 3.69 (2H, t), 4.98 (2H, s), 7.34 (1H, d), 7.67 (1H, dd), 8.38 (1H, d), 9.31 (1H, d), 9.46 (1H, d)	m/z=334 (M+H)
285	HOOC-CH ₂ NHCOOtBu	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	1.45 (9H, s), 3.16 (2H, t), 3.58 (2H, t), 4.06 (1H, d), 4.81 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	m/z=385 (M+H)
286	HOOC-2-oxirane	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	2.93 (1H, dd), 3.00 (1H, dd), 3.17 (2H, t), 3.58 (1H, dd), 3.60 (2H, t), 4.81 (1H, d), 4.86 (1H, d), 7.34 (1H, d), 7.67 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	m/z=298 (M+H)
287	(3-bromophenyl)-COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.20 (2H, t), 3.63 (2H, t), 4.97 (2H, s), 7.28-7.25 (2H, m), 7.63 (1H, dd), 7.89 (1H, dd), 8.18 (1H, d), 8.38 (2H, m)	m/z=410 (M+H)
288	HOOC-3-azetydine	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.14 (2H, t), 3.49 (1H, m), 3.58 (2H, t), 3.74 (2H, m), 2.97 (2H, m), 4.81 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.83 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	m/z=311 (M+H)
289	(2-pyridyl)-COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.21 (2H, t), 3.64 (2H, t), 5.00 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.40 (1H, m), 7.79 (2H, m), 8.29 (1H, d), 8.42 (1H, s), 8.77 (1H, d)	m/z=333 (M+H)
290	HOOC-4-pyridyl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.23 (2H, t), 3.68 (2H, t), 4.98 (2H, s), 7.32 (1H, m), 7.67 (1H, dd), 8.30 (2H, m), 8.40 (1H, d), 8.74 (2H, m)	m/z=333 (M+H)
291	HOOC-(5-chloro-2-thienyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.21 (2H, t), 3.63 (2H, t), 4.87 (2H, s), 6.93 (1H, t), 7.35 (1H, dd), 7.64 (1H, m), 7.73 (1H, dd), 8.40 (1H, d)	
292	(2-fluorophenyl)-COOH	3-(2-chloro-5-thiazolylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.21 (2H, t), 3.68 (2H, t), 4.99 (2H, s), 7.13 (1H, dd), 7.21 (1H, m), 7.49 (1H, m), 7.50 (1H, s), 8.17 (1H, dd)	
293	PhCOCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminoimidazolidine	5	3.41 (2H, t), 3.71 (2H, t), 4.71 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.40 (2H, m), 7.46 (1H, m), 7.73 (1H, dd), 8.24 (2H, m), 8.38 (1H, d), 8.89 (1H, br s)	m/z=315 (M+H)
294	(2-fluorophenyl)-COOH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminoimidazolidine	1,2	3.41 (2H, t), 3.71 (2H, t), 4.65 (2H, s), 7.05-7.18 (2H, m), 7.32 (1H, d), 7.39 (1H, m), 7.73 (1H, dd), 8.01 (1H, td), 8.37 (1H, d), 8.81 (1H, br s)	
295	PhCOCl	3-(2-trifluoromethyl-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.20 (2H, t), 3.63 (2H, t), 5.08 (2H, s), 7.42 (2H, m), 7.51 (1H, m), 7.67 (1H, d), 7.90 (1H, d), 8.25 (2H, d), 8.74 (1H, s)	m/z=368 (M+H)
296	(2-fluorophenyl)-COOH	3-(2-trifluoromethyl-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1,2	3.21 (2H, t), 3.66 (2H, t), 5.03 (2H, s), 7.10 (1H, dd), 7.19 (1H, m), 7.45 (1H, m), 7.89 (1H, d), 7.94 (1H, d), 8.08 (1H, td), 8.74 (1H, s)	m/z=384 (M+H)
297	PhCOCl	3-(2-trifluoromethyl-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.21 (2H, t), 3.65 (2H, t), 4.93 (2H, s), 7.18 (3H, m), 7.37 (2H, m), 7.69 (1H, d), 7.85 (1H, dd), 8.08 (1H, d)	m/z=382 (M+H)
298	(2-trifluoromethylphenyl)-COCl	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	2.85 (3H, s), 4.58 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.43 (2H, m), 7.50 (1H, m), 7.65 (1H, dd), 8.23 (2H, m), 8.38 (1H, d)	m/z=400 (M+H)
299	PhCOCl	3-(5,6-dichloro-3-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.29 (2H, t), 3.63 (2H, t), 4.96 (2H, s), 7.43 (2H, m), 7.51 (1H, m), 7.82 (1H, d), 8.24 (2H, m), 8.31 (1H, d)	m/z=366 (M+H)
300	PhCOCl	3-(6-fluoro-3-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.17 (2H, t), 3.61 (2H, t), 4.98 (2H, s), 6.93 (1H, d), 7.43 (2H, m), 7.51 (1H, m), 7.88 (1H, td), 8.22 (1H, d), 8.26 (2H, d)	m/z=316 (M+H)
301	PhCOCl	3-(6-chloro-5-fluoro-3-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.20 (2H, t), 3.63 (2H, t), 4.98 (2H, s), 7.41-7.58 (4H, m), 8.24 (2H, m)	m/z=350 (M+H)
302	PhCOCl	3-(6-bromo-3-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	5	3.15 (2H, t), 3.59 (2H, t), 4.93 (2H, s), 7.42-7.62 (5H, m), 8.24 (2H, m), 8.38 (1H, d)	m/z=376 (M+H)
303	HO-CH ₂ CH ₂ C≡CH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3,4	2.00 (1H, d), 2.63 (2H, td), 3.18 (2H, t), 3.58 (2H, t), 4.28 (2H, t), 4.83 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	m/z=324 (M+H)

[表16]

化合物編號	原料1	原料2	合成例	NMR (CDCl ₃ , δ, ppm)	IR (KBr, v. cm ⁻¹) or MS
304	HOOC-CH ₂ CH ₂ -(2-methoxyphenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.80(1H,m), 3.00(1H,m), 3.11(2H,m), 3.81(3H,s), 4.12(2H,s), 6.85(2H,m), 7.17(2H,m), 7.30(1H,t), 7.82(1H,m), 8.33(1H,s)	m/z=390 (M+H)
305	HOOC-CH ₂ CH ₂ -(2-methoxyphenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.85(1H,t), 3.04(1H,m), 3.14(1H,t), 3.60(1H,t), 3.63(3H,s), 4.13(1H,q), 4.83(2H,s), 6.85(1H,d), 6.89(1H,d), 7.20(2H,m), 7.45(1H,s)	m/z=396 (M+H)
306	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.96 (3H, m), 2.33 (2H, td), 3.16 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.27 (2H, t), 4.85 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.84 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	m/z=338 (M+H)
307	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.84 (2H, m), 1.84 (2H, m), 1.84 (1H, d), 2.23 (2H, td), 3.18 (2H, t), 3.58 (2H, t), 4.10 (2H, t), 4.81 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.84 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	m/z=352 (M+H)
308	HOOC-CH ₂ CH ₂ C≡CH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.96 (3H, m), 2.56 (2H, td), 2.73 (2H, t), 3.13 (2H, t), 3.56 (2H, t), 4.82 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.87 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	m/z=308 (M+H)
309	HOOC-CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.92 (3H, m), 2.27 (2H, t), 2.61 (2H, t), 3.12 (2H, t), 3.53 (2H, t), 4.80 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	m/z=322 (M+H)
310	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.50 (2H, m), 1.75 (2H, m), 2.09 (2H, q), 3.18 (2H, t), 3.56 (2H, t), 4.17 (2H, t), 4.81 (2H, s), 4.96 (1H, m), 5.02 (1H, m), 5.81 (1H, m), 7.29 (1H, d), 7.84 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	m/z = 354 (M+H)
311	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	3-(2-chloro-5-thiazolylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.51 (2H, m), 1.78 (2H, m), 2.13 (2H, m), 3.17 (2H, t), 3.83 (2H, t), 4.21 (2H, t), 4.98 (1H, m), 5.04 (1H, m), 5.80 (1H, m), 7.45 (1H, s)	m/z = 360 (M+H)
312	HOOC-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.60 (2H, m), 1.77 (2H, m), 1.94 (1H, t), 2.22 (2H, td), 2.50 (2H, t), 3.13 (2H, t), 3.53 (2H, t), 4.80 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.85 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	m/z = 336 (M+H)
313	HOOC-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH	3-(2-chloro-5-thiazolylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.60 (2H, m), 1.84 (2H, m), 1.95 (1H, t), 2.25 (2H, td), 2.58 (2H, t), 3.14 (2H, t), 3.60 (2H, t), 4.83 (2H, s), 7.45 (1H, d)	m/z = 342 (M+H)
314	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.83 (2H, m), 2.17 (2H, m), 3.16 (2H, t), 3.58 (2H, t), 4.18 (2H, t), 4.98 (1H, m), 5.04 (1H, m), 5.83 (1H, m), 7.33 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	m/z = 340 (M+H)
315	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	3-(2-chloro-5-thiazolylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.84 (2H, m), 2.17 (2H, m), 3.17 (2H, t), 3.63 (2H, t), 4.20 (2H, t), 4.88 (2H, s), 4.99 (1H, m), 5.06 (1H, m), 5.85 (1H, m), 7.45 (1H, s)	m/z = 346 (M+H)
316	HOOC-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.44 (2H, m), 1.70 (2H, m), 2.07 (2H, m), 2.49 (2H, t), 3.11 (2H, t), 3.53 (2H, t), 4.80 (2H, s), 4.94 (1H, m), 5.00 (1H, m), 5.82 (1H, m), 7.40 (1H, d), 7.84 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	m/z = 338 (M+H)
317	HOOC-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	3-(2-chloro-5-thiazolylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.40 (2H, m), 1.74 (2H, m), 2.10 (2H, m), 2.54 (2H, t), 3.13 (2H, t), 3.59 (2H, t), 4.83 (2H, s), 4.95 (1H, m), 5.03 (1H, m), 5.83 (1H, m), 7.45 (1H, s)	m/z = 344 (M+H)
318	HOOC-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.78 (2H, m), 2.11 (2H, m), 2.50 (2H, t), 3.11 (2H, t), 3.53 (2H, t), 4.80 (2H, s), 4.98 (1H, m), 5.03 (1H, m), 5.82 (1H, m), 7.33 (1H, d), 7.84 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	m/z = 324 (M+H)
319	HOOC-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	3-(2-chloro-5-thiazolylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.82 (2H, m), 2.14 (2H, m), 2.54 (2H, t), 3.13 (2H, t), 3.59 (2H, t), 4.84 (2H, s), 4.97 (1H, m), 5.05 (1H, m), 5.85 (1H, m), 7.45 (1H, s)	m/z = 330 (M+H)
320	HOOC-CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.43 (2H, m), 2.58 (2H, m), 3.12 (2H, t), 3.54 (2H, t), 4.81 (2H, s), 4.97 (1H, m), 5.06 (1H, m), 5.89 (1H, m), 7.40 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	m/z = 310 (M+H)
321	HOOC-CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	3-(2-chloro-5-thiazolylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.47 (2H, m), 2.63 (2H, m), 3.14 (2H, t), 3.60 (2H, t), 4.84 (2H, s), 4.99 (1H, m), 5.07 (1H, m), 5.92 (1H, m), 7.45 (1H, s)	m/z = 316 (M+H)
322	HO-CH ₂ CH ₂ CF ₃	3-(2-chloro-5-thiazolylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.48 (3H, d), 3.21 (2H, t), 3.68 (2H, t), 4.88 (2H, s), 5.32 (1H, m), 7.48 (1H, s)	m/z = 374 (M+H)
323	HOOC-CH=CH-(3-thienyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.14 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.89 (2H, s), 6.58 (1H, d), 7.32 (3H, m), 7.46 (1H, d), 7.70 (1H, dd), 7.77 (1H, d), 8.37 (1H, d)	m/z = 364 (M+H)
324	HOOC-CH=CH-(4-(2-thienyl)-2-thienyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.15 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.89 (2H, s), 6.53 (1H, m), 7.10 (1H, dd), 7.13 (1H, dd), 7.27 (1H, d), 7.27 (1H, d), 7.35 (1H, d), 7.69 (1H, dd), 7.81 (1H, d), 8.37 (1H, d)	m/z = 446 (M+H)
325	HO-CH ₂ CH=CH-(3-thienyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	3.17 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.82 (2H, s), 6.84 (2H, s), 6.23 (1H, d), 6.87 (1H, d), 7.22 (1H, dd), 7.26 (1H, m), 7.32 (1H, d), 7.84 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	

[表17]

化合物編號	原料1	原料2	合成例	NMR (CDCl ₃ δ, ppm)	IR (KBr, v. cm ⁻¹) or MS
326	HOOC-CH ₂ -(2-tetrahydrofuryl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.57 (1H, m), 1.89 (2H, m), 2.08 (1H, m), 2.02 (1H, dd), 2.80 (1H, dd), 3.11 (2H, t), 3.53 (2H, t), 3.73 (1H, m), 3.88 (1H, m), 4.38 (1H, m), 4.81 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.67 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	m/z = 340 (M+H)
327	HOOC-CH=CH-(2-furanyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.14 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.89 (2H, s), 6.46 (1H, dd), 6.58 (1H, d), 6.63 (1H, d), 7.32 (1H, d), 7.47 (1H, d), 7.69 (1H, dd), 8.37 (1H, d)	m/z = 347 (M+H)
328	HOOC-CH ₂ CH ₂ -(2-thienyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.88 (2H, t), 3.12 (2H, t), 3.24 (2H, t), 3.54 (2H, t), 4.80 (2H, s), 6.82 (1H, d), 6.90 (1H, dd), 7.10 (1H, dd), 7.30 (1H, d), 7.80 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	m/z = 366 (M+H)
329	HO-CH ₂ CH ₂ -(2-tetrahydrofuryl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.50 (1H, m), 1.82 (7H, m), 3.15 (2H, t), 3.58 (2H, t), 3.72 (1H, m), 3.88 (1H, dd), 3.95 (1H, dd), 4.26 (2H, m), 4.81 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.64 (1H, d), 8.31 (1H, d)	m/z = 370 (M+H)
330	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-thienyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	2.10 (2H, m), 2.88 (2H, t), 3.16 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.23 (2H, t), 4.82 (2H, s), 6.81 (1H, d), 6.91 (1H, dd), 7.11 (1H, dd), 7.32 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	m/z = 396 (M+H)
331	HOOC-CH=CH-(2-thienyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.15 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.90 (2H, s), 6.54 (1H, d), 7.04 (1H, dd), 7.23 (1H, d), 7.34 (1H, dd), 7.70 (1H, dd), 7.88 (1H, d), 8.37 (1H, d)	m/z = 364 (M+H)
332	HOOC-CH ₂ CH ₂ -(2-furanyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.84 (2H, t), 3.01 (2H, t), 3.12 (2H, t), 3.54 (2H, t), 4.80 (2H, s), 6.00 (1H, d), 6.20 (1H, dd), 7.29 (1H, d), 7.31 (1H, d), 7.60 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	m/z = 350 (M+H)
333	HOOC-CH ₂ CH ₂ CF ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.52 (2H, m), 2.75 (2H, m), 3.14 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.81 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.62 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	m/z = 352 (M+H)
334	HOOC-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.85 (2H, m), 2.58 (2H, t), 3.12 (2H, t), 3.3 (3H, s), 3.43 (2H, t), 3.52 (2H, t), 4.80 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.84 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	m/z = 328 (M+H)
335	HOOC-CH ₂ -(3-tetrahydrofuryl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.58 (1H, m), 2.13 (1H, m), 2.60 (2H, m), 2.71 (1H, m), 3.13 (2H, t), 3.45 (1H, m), 3.52 (2H, t), 3.77 (1H, q), 3.85 (1H, m), 3.99 (1H, m), 4.80 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.61 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	m/z = 340 (M+H)
336	HOOC-CH ₂ CH ₂ -(2-tetrahydrofuryl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.49 (1H, m), 1.80-2.05 (5H, m), 2.81 (2H, m), 3.11 (2H, t), 3.53 (2H, t), 3.71 (1H, m), 3.84 (2H, m), 4.84 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	m/z = 354 (M+H)
337	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-furanyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	2.06 (2H, m), 2.76 (2H, t), 3.16 (2H, t), 3.58 (2H, t), 4.21 (2H, t), 4.81 (2H, s), 6.01 (1H, dd), 6.27 (1H, dd), 7.30 (1H, d), 7.33 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	m/z = 380 (M+H)
338	HO-CH ₂ CH ₂ -(3-tetrahydrofuryl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.86 (1H, m), 1.83 (2H, m), 2.08 (1H, m), 2.32 (1H, m), 3.17 (2H, t), 3.40 (1H, dd), 3.58 (2H, t), 3.76 (1H, m), 3.88 (1H, m), 3.94 (1H, m), 4.20 (2H, m), 4.81 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	m/z = 370 (M+H)
339	HOOC-CH=CH-(3-furanyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.14 (2H, t), 3.56 (2H, t), 4.89 (2H, s), 6.46 (1H, d), 6.64 (1H, s), 7.32 (1H, d), 7.42 (1H, s), 7.63 (1H, s), 7.69 (2H, m), 8.32 (1H, d)	m/z = 348 (M+H)
340	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-tetrahydrofuryl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.40-2.01 (8H, m), 3.15 (2H, t), 3.55 (2H, t), 3.71 (1H, dd), 3.84 (2H, t), 4.20 (2H, m), 4.81 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.30 (1H, d)	m/z = 384 (M+H)
341	HOOC-CH ₂ CH ₂ -(3-furanyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.75 (2H, m), 2.82 (2H, m), 3.11 (2H, t), 3.55 (2H, t), 4.80 (2H, s), 6.29 (1H, d), 7.24 (1H, d), 7.32 (1H, d), 7.34 (1H, d), 7.60 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	m/z = 350 (M+H)
342	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	2.00 (2H, m), 2.24 (2H, m), 3.17 (2H, t), 3.58 (2H, t), 4.23 (2H, t), 4.82 (2H, s), 7.34 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	m/z = 370 (M+H)
343	HOOC-CH ₂ CH ₂ -(4-methoxyphenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.78 (2H, t), 2.96 (2H, t), 3.11 (2H, t), 3.52 (2H, t), 3.78 (3H, s), 4.78 (2H, s), 6.81 (2H, d), 7.14 (2H, d), 7.29 (1H, d), 7.56 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	
344	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.99 (2H, m), 3.15 (2H, t), 3.34 (3H, s), 3.49 (2H, t), 3.56 (2H, t), 4.29 (2H, t), 4.82 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	m/z = 344 (M+H)
345	HOOC-CH ₂ CH ₂ -(3,5-dimethoxyphenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.81 (2H, t), 2.98 (2H, t), 3.14 (2H, t), 3.51 (2H, t), 3.75 (6H, s), 4.79 (2H, s), 6.29 (1H, d), 6.39 (2H, d), 7.30 (1H, d), 7.60 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	

[表18]

化合物編號	原料1	原料2	合成例	NMR (CDCl ₃ , δ, ppm)	IR (KBr, v cm ⁻¹) or MS
346	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.68 (2H, m), 1.78 (2H, m), 3.16 (2H, t), 3.33 (3H, s), 3.41 (2H, t), 3.58 (2H, t), 4.20 (2H, t), 4.80 (2H, s), 7.34 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	m/z = 358 (M+H)
347	HO-CH ₂ -(3-methoxyphenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	3.16 (2H, t), 3.58 (2H, t), 3.81 (3H, s), 4.80 (2H, s), 5.19 (2H, s), 6.84 (1H, m), 7.00 (2H, m), 7.24 (1H, m), 7.32 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	m/z = 392 (M+H)
348	HO-CH ₂ CH ₂ -(3-methoxyphenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	3.02 (2H, t), 3.17 (2H, t), 3.57 (2H, t), 3.80 (3H, s), 4.37 (2H, t), 4.80 (2H, t), 6.80 (3H, m), 7.22 (1H, m), 7.32 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	m/z = 406 (M+H)
349	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-furanyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.98 (2H, m), 2.54 (2H, t), 3.16 (2H, t), 3.56 (2H, t), 4.21 (2H, t), 4.81 (2H, s), 6.28 (1H, s), 7.23 (1H, d), 7.33 (1H, d), 7.34 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	m/z = 380 (M+H)
350	HOOC-CH ₂ CH ₂ -(3-tetrahydrofuryl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.35 (1H, m), 1.78 (3H, m), 2.04 (1H, m), 2.23 (1H, m), 2.50 (2H, m), 3.12 (2H, t), 3.36 (1H, t), 3.54 (2H, t), 3.75 (1H, q), 3.85 (2H, m), 4.80 (2H, s), 7.31 (1H, d), 8.62 (1H, dd), 8.34	m/z = 354 (M+H)
351	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(3-tetrahydrofuryl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	1.48-1.74 (5H, m), 2.03 (1H, m), 2.20 (1H, m), 3.16 (2H, t), 3.34 (1H, m), 3.57 (2H, t), 3.75-3.92 (3H, m), 4.17 (2H, t), 4.81 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	m/z = 384 (M+H)
352	HO-CH ₂ CH ₂ -(2-thienyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	3.17 (2H, t), 3.25 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.39 (2H, t), 4.82 (2H, s), 6.89 (1H, dd), 6.94 (1H, dd), 7.16 (1H, dd), 7.33 (1H, d), 7.67 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	m/z = 382 (M+H)
353	HOOC-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.88 (2H, m), 2.49 (2H, t), 2.58 (2H, t), 3.12 (2H, t), 3.52 (2H, t), 4.21 (4H, s), 4.76 (2H, s), 6.66 (1H, dd), 6.70 (1H, d), 6.77 (1H, d), 7.31 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	
354	HO-CH ₂ CH ₂ -(3-thienyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	3.17 (2H, t), 3.17 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.37 (2H, t), 4.80 (2H, s), 7.00 (1H, dd), 7.06 (1H, dd), 7.26 (1H, dd), 7.32 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	m/z = 382 (M+H)
355	HOOC-CH ₂ CH ₂ -(benzo[d][1,3]dioxol-5-yl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.77 (2H, t), 2.94 (2H, t), 3.12 (2H, t), 3.53 (2H, t), 4.79 (2H, s), 5.91 (2H, s), 6.68 (1H, dd), 6.71 (1H, d), 6.73 (1H, d), 7.30 (1H, d), 7.58 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	
356	HO-CH ₂ CH ₂ CF ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	2.57 (2H, m), 3.18 (2H, t), 3.60 (2H, t), 4.36 (2H, t), 4.81 (2H, s), 7.34 (1H, d), 7.66 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	m/z = 368 (M+H)
357	HOOC-CH ₂ CH ₂ -(2,3-dihydrobenzo[b][1,4]dioxin-6-yl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.77 (2H, t), 2.92 (2H, t), 3.12 (2H, t), 3.53 (2H, t), 4.22 (4H, s), 4.79 (2H, s), 6.69 (1H, dd), 6.73 (1H, d), 6.76 (1H, d), 7.32 (1H, d), 7.62 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	m/z = 418 (M+H)
358	HOOC-CH ₂ CH ₂ -(3-methoxyphenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.84 (2H, t), 3.00 (2H, t), 3.53 (2H, t), 3.78 (3H, s), 4.78 (2H, s), 6.73 (1H, d), 6.78 (1H, d), 6.83 (1H, d), 7.13 (1H, t), 7.30 (1H, d), 7.58 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	m/z = 390 (M+H)
359	HO-CH ₂ CH ₂ -(2-furanyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	3.07 (2H, t), 3.16 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.11 (2H, t), 4.80 (2H, s), 6.10 (1H, d), 6.29 (1H, d), 7.30 (1H, d), 7.33 (1H, d), 7.63 (1H, dd), 8.30 (1H, d)	m/z = 366 (M+H)
360	HO-CH ₂ CH ₂ -(3-furanyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	2.85 (2H, t), 3.16 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.31 (2H, t), 4.81 (2H, s), 6.33 (1H, s), 7.31 (1H, d), 7.33 (1H, d), 7.36 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	m/z = 366 (M+H)
366	HO-CH ₂ -(2-thienyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	3.14 (2H, t), 3.53 (2H, t), 4.77 (2H, s), 5.34 (2H, s), 6.86 (1H, dd), 7.13 (1H, dd), 7.30 (1H, d), 7.62 (1H, dd), 8.28 (1H, d)	
367	HO-CH ₂ -(3-thienyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	3.15 (2H, t), 3.55 (2H, t), 4.78 (2H, s), 5.20 (2H, s), 7.16 (1H, d), 7.27-7.35 (3H, m), 7.84 (1H, dd), 8.30 (1H, d)	1650, 1546, 1460, 1440, 1415
372	HOOC-CH=CHCF ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.19 (2H, t), 3.63 (2H, t), 4.86 (2H, s), 6.72 (1H, d), 6.80 (1H, m), 7.34 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.34 (1H, d)	1714, 1637, 1616, 1540
373	HO-CH ₂ CH ₂ CN	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	2.79 (2H, t), 3.20 (2H, t), 3.61 (2H, t), 4.37 (2H, t), 4.81 (2H, s), 7.33 (1H, d), 7.67 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	1671, 1549, 1457, 1431
374	BrCOCH ₂ Br, HOOC-CH ₂ OCH ₂ C≡CH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	2.44 (1H, t), 3.16 (2H, t), 3.58 (2H, t), 4.33 (2H, s), 4.36 (2H, d), 4.81 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.65 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	

[表19]

化合物編號	原料1	原料2	合成例	NMR (CDCl ₃ , δ, ppm)	IR (KBr, v. cm ⁻¹) or MS
429	BrCOCH ₂ Br, HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	1.85 (2H, m), 2.25 (2H, m), 3.18 (2H, s), 3.54 (2H, t), 3.60 (2H, t), 4.18 (2H, s), 4.77 (2H, s), 7.29 (1H, d), 7.60 (1H, dd), 8.30 (1H, d)	1653, 1534, 1461, 1414
430	BrCOCH ₂ Br, HO-CH ₂ -(2-furanyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	3.15 (2H, t), 3.57 (2H, t), 4.21 (2H, s), 4.65 (2H, s), 4.80 (2H, s), 6.34 (2H, m), 7.31 (1H, d), 7.39 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.32 (1H, d)	
431	BrCOCH ₂ Br, HO-CH ₂ -(3-furanyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	3.18 (2H, t), 3.66 (2H, t), 4.22 (2H, s), 4.66 (2H, s), 4.82 (2H, s), 6.45 (1H, d), 7.31 (1H, d), 7.39 (1H, d), 7.49 (1H, s), 7.65 (1H, dd), 8.35 (1H, d)	
432	HOOC-(4-ethynylphenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.28 (1H, s), 3.21 (2H, t), 3.74 (2H, t), 5.00 (2H, s), 7.46 (1H, d), 7.52 (2H, d), 7.64 (1H, dd), 8.12 (2H, d), 8.46 (1H, d)	1617, 1527, 1462, 1419
427	BrCH ₂ OOBr, HO-CH ₂ CH ₂ CF ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	7	2.48 (2H, m), 3.16 (2H, t), 3.57 (2H, t), 3.82 (2H, t), 4.23 (2H, s), 4.79 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.64 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	m/z = 382 (M+H)
428	HOOC-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ C≡CH	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.97 (1H, t), 2.55 (2H, td), 3.15 (2H, t), 3.57 (2H, t), 3.73 (2H, t), 4.21 (2H, s), 4.80 (2H, s), 7.32 (1H, d), 7.63 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	m/z = 338 (M+H)
392	HOOC-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	1.93 (2H, m), 2.18 (2H, m), 2.57 (2H, t), 3.13 (2H, t), 3.58 (2H, t), 4.80 (2H, s), 7.31 (1H, d), 7.63 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	m/z = 365 (M+H)
433	HOOC-CH ₂ OCH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	2.42 (2H, d), 3.14 (2H, t), 3.56 (2H, t), 3.64 (2H, t), 4.22 (2H, s), 4.80 (2H, s), 5.01 (1H, dd), 5.13 (1H, dd), 5.86 (1H, m), 7.31 (1H, d), 7.63 (1H, dd), 8.33 (1H, d)	m/z = 340 (M+H)
434	HOOC-CH ₂ OCH ₂ CH=CH ₂	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	1.2	3.13 (2H, t), 3.55 (2H, t), 4.14 (2H, d), 4.21 (2H, t), 4.79 (2H, d), 5.18 (1H, dd), 5.31 (1H, dd), 5.94 (1H, m), 7.32 (1H, d), 7.63 (1H, dd), 8.31 (1H, d)	m/z = 326 (M+H)
435	HO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -(2-methoxyphenyl)	3-(2-chloro-5-pyridinylmethyl)-2-iminothiazolidine	3.4	2.03(2H, m), 2.72(2H, t), 3.15(2H, t), 3.56(2H, t), 3.91(3H, s), 4.20(2H, t), 4.62(2H, s), 6.84(1H, d), 6.87(1H, dt), 7.14(1H, dd), 7.18(1H, dd), 7.32(1H, dd), 7.66(1H, dd), 8.31(1H, d)	m/z = 420 (M+H)

[製劑例]

製劑例 1 [粒劑]

化合物 6	5 重量 %
膨土	40 重量 %
滑石	10 重量 %
黏土	43 重量 %
木質素 氫酸鈣	2 重量 %

使上述成分均一粉碎混合，加入水充分混合後，進行造粒乾燥得到粒劑。

製劑例 2〔水合劑〕

化合物 6	30 重量%
黏土	50 重量%
白碳	2 重量%
矽土	13 重量%
木質素磺酸鈣	4 重量%
月桂基硫酸鈉	1 重量%

使上述成分均一混合，進行粉碎而得到水合劑。

製劑例 3〔顆粒水合劑〕

化合物 6	30 重量%
黏土	60 重量%
糊精	5 重量%
烷基馬來酸共聚合物	4 重量%
月桂基硫酸鈉	1 重量%

使上述成分均一粉碎混合，加入水充分混合後，進行造粒乾燥而得到顆粒水合劑。

製劑例 4〔乳劑〕

化合物 51	15 重量%
N, N-二甲基甲醯胺	20 重量%
Solvesso150 (Exxon Mobil 有限會公司)	55 重量%

聚氧化伸乙基烷基芳基醚 10 重量 %

使上述成分均一混合，進行溶解而得到乳劑。

製劑例 5 [粉劑]

化合物 51 2 重量 %

黏土 60 重量 %

滑石 37 重量 %

硬脂酸鈣 1 重量 %

使上述成分均一混合而得到粉劑。

製劑例 6 [液化滴劑]

化合物 6 24 重量 %

乙醇 76 重量 %

使上述成分均一混合而得到液化滴劑。

製劑例 7 [液化滴劑]

化合物 6 48 重量 %

乙醇 52 重量 %

使上述成分均一混合而得到液化滴劑。

[試驗例]

試驗例 1 (長角血蜱防除試驗)

將化合物之 200ppm、10ppm、1.7ppm 之丙酮溶液 30 μ L 置入 4mL 容積玻璃瓶，使其放置於振盪機，於瓶內壁形成化合物之乾膜。24 小時以上、使瓶乾燥後，於此中飼養長角血蜱幼蜱 10 隻並加蓋。瓶於 25℃、濕度 85%、全暗條件的恆溫室中靜置。飼養 1 日後觀察生死，以下式算出死蟲率。試驗以 2 連制進行。

$$\text{死蟲率 (\%)} = \{ \text{死亡數} / (\text{生存數} + \text{死亡數}) \} \times 100$$

其結果，表示以下之化合物以 200ppm 之藥液形成的乾膜上 60%以上之死蟲率。

2、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、
18、21、28、29、42、43、44、45、46、47、48、51、52
、53、57、58、59、61、62、64、67、70、72、73、75、
76、77、78、81、83、88、89、90、93、100、
104、106、107、113、114、115、117、119、120、121、
122、123、124、125、126、127、128、129、131、132、
133、134、135、139、140、141、142、143、144、145、
147、150、151、153、154、155、156、163、167、171、
173、175、176、177、179、180、182、184、185、189、
190、197、198、199、200、201、202、203、204、205、
206、207、208、209、210、211、213、214、215、216、

217、218、219、220、221、222、226、227、228、229、
230、231、232、233、234、235、239、240、241、242、
243、244、247、248、249、251、252、254、255、256、
258、259、260、263、264、265、267、268、270、271、
273、274、277、278、279、283、284、287、289、290、
291、292、299、300、301、302、303、304、305、306、
307、308、309、310、311、312、313、314、315、316、
317、318、319、320、321、322、326、327、328、329、
330、332、333、334、335、336、337、338、339、340、
341、342、343、344、345、346、347、348、349、350、
353、354、357、358、359、360、361、362、366、367、
372、373、374、427、428、429、430、431

爲以下之化合物以 10ppm 之藥液形成的乾膜上有
60%以上之死蟲率。

2、5、6、7、8、9、10、12、18、42、43、44、45、47、
51、53、57、58、59、61、70、72、75、76、81、83、88
、106、107、113、114、115、122、123、124、125、126
、128、129、132、134、135、139、141、142、144、145
、149、155、167、171、173、184、185、189、190、197
、198、199、201、203、210、211、213、214、215、216
、219、220、226、227、228、229、230、233、240、241
、244、246、248、249、251、254、255、256、258、259
、260、267、268、283、284、292、299、300、301、302
、303、304、305、306、307、308、309、310、311、312

、 313、314、315、316、318、321、322、326、328、331
、 333、334、335、336、337、338、339、340、341、342
、 343、344、345、346、348、349、350、354、355、356
、 357、358、359、361、362、366、367、373、374、427
、 429、430、431

以下之化合物以 1.7ppm 之藥液形成的乾膜上有 60% 以上之死蟲率。

6、42、43、44、45、57、61、72、76、81、83、106、
107、113、114、115、122、123、124、125、128、132、
134、135、139、141、144、145、155、167、171、198、
211、213、216、226、227、228、230、233、240、241、
244、251、255、267、268、283、292、299、302、303、
308、309、313、326、328、329、336、337、338、341、
343、345、349、351、352、354、355、358、359、366、
374、430、431

試驗例 2 (小鼠體表上的長角血蜱防除試驗)

使小鼠 (ICR、雄、5 週齡) 之背面體毛刮除直徑約 2cm，於其使高約 1.5cm 處切斷的 15mL 聚苯乙烯錐形管以瞬間接著劑接著。

將與製劑例 7 同樣調製的有害生物防除劑之 1000 倍稀釋液 20 μ L 滴下於接著管內之小鼠體表。使充分乾燥後，將長角血蜱幼蜱 10 隻以上飼養於管內並加蓋。飼養 3 日後觀察長角血蜱之生死，以下式算出死蟲率。

$$\text{死蟲率}(\%) = \{ \text{死亡數} / (\text{生存數} + \text{死亡數}) \} \times 100$$

其結果，以下之化合物有 60%以上之死蟲率。

81、173、283

試驗例 3 (腐食酪蟻防除試驗)

使化合物之 50ppm 之丙酮溶液 30 μ L 放入 4mL 容積玻璃瓶。使其放置於振盪機，於瓶內壁形成化合物之乾膜。24 小時以上、使瓶乾燥後，於其中飼養腐食酪蟻成蟬 5 隻後，以脫脂綿加蓋。瓶靜置於 25 $^{\circ}$ C、濕度 85%、16 小時明期、8 小時暗期條件的恆溫室。飼養 1 日後觀察生死，以下式算出死蟲率。試驗以 2 連制進行。

$$\text{死蟲率}(\%) = \{ \text{死亡數} / (\text{生存數} + \text{死亡數}) \} \times 100$$

其結果，以下之化合物在 50ppm 之藥液形成的乾膜上有 90%以上之死蟲率。

2、42

試驗例 4 對 (犬糸條蟲 (*Dirofilaria immitis*) 之微絲蟲的效果；試驗管內試驗)

藉由 *D. immitis* 微絲蟲之運動性變化評估化合物之活性。使本發明化合物以化合物濃度為 12.5ppm、6.25ppm、及 3.13ppm 之方式以 RPMI1640 液體培養基溶解後，*D.*

immitis 微絲蟲每 1 培養液放入約 20 隻，在 37°C 進行培養。培養開始後 48 小時觀察 *D. immitis* 微絲蟲之運動性，對 90% 以上之蟲體有影響或 1/3 以上之蟲體死亡的化合物判定為有效。

其結果，以下之化合物在 12.5ppm 有效。

6、28、36、48、49、52、53、57、73、75、83、111、120、154、177、196、197、198、199、201、202、203、205、226、253、254、261、262、263、267、271、299、308、309

以下之化合物在 6.25ppm 為有效。

28、48、52、53、73、75、83、84、111、120、196、198、199、202、203、205、221、226、253、261、262、263、267、271、299、308、309、357、372

以下之化合物在 3.13ppm 為有效。

52、53、73、75、83、84、111、203、226、261、262、263、267、271、299、308、309、372

試驗例 5 對雞蛔蟲 (*Ascaridia galli*) 之成蟲的效果 (試驗管內試驗)

藉由 *A. galli* 成蟲的運動性變化評估化合物之活性。使本發明化合物以二甲基亞砷溶解後，以化合物濃度成為 50ppm 之方式加入以林格氏液溶解的 *A. galli* 之培養液。*A. galli* 成蟲每 1 培養液加入 6 隻，在 41°C 進行培養。培養開始後 24 小時觀察 *A. galli* 成蟲的運動性，並評估化

合物之活性。

培養開始後 24 小時觀察 *A. galli* 成蟲的運動性，自動運動停止蟲體數 4 隻以上的化合物為有效。結果以下之化合物為有效。

142

試驗例 6 (家蠅防除試驗)

使化合物溶於 5%蔗糖溶液調整為 7.5ppm 之藥液。在敷有濾紙的 200mL 容積塑膠杯中放入羽化 24 小時的家蠅雌成蟲 5 隻，同時置入含有化合物的 5%蔗糖溶液 4mL 之脫脂綿，在 25℃、16 小時明期、8 小時暗期條件下靜置。飼養 1 日後觀察生死，以下式算出死蟲率。試驗以 2 連制進行。

$$\text{死蟲率 (\%)} = \{ \text{死亡數} / (\text{生存數} + \text{死亡數}) \} \times 100$$

其結果，以下之化合物有 90%以上之死蟲率。

42

試驗例 7 (家蠅防除試驗)

使化合物之丙酮溶液 1 μ L 局部施用於羽化 24 小時以內家蠅雌成蟲的背面胸部。在敷有濾紙的 200mL 容積塑膠杯中置入家蠅雌成蟲與含 5%蔗糖溶液 4mL 的脫脂綿，在 25℃、16 小時明期、8 小時暗期條件下靜置。飼養 1

日後觀察生死，以下式算出死蟲率。試驗以 2 連制進行。

$$\text{死蟲率}(\%) = \{ \text{死亡數} / (\text{生存數} + \text{死亡數}) \} \times 100$$

其結果，以下之化合物以 $0.1 \mu\text{g}/\text{隻}$ 處理藥量有 70% 以上之死蟲率。

240

試驗例 8 (淡色庫蚊防除試驗)

調整含化合物之 0.1% 丙酮溶液 1 mL。於溶液中少量加入混合作為餌之乾燥酵母與粉末化的小鼠固形飼料者。於此飼養淡色庫蚊孵化幼蟲 10 隻，在 25℃、16 小時明期、8 小時暗期條件下靜置。飼養 1 日後觀察生死，以下式算出死蟲率。試驗以 2 連制進行。

$$\text{死蟲率}(\%) = \{ \text{死亡數} / (\text{生存數} + \text{死亡數}) \} \times 100$$

其結果，以下之化合物以 1 ppm 處理藥量有 60% 以上之死蟲率。

240

由試驗例 1~8，本發明之化合物對動物寄生性害蟲及衛生害蟲有優異防除效果，該防除效果與目前有報告的農業領域害蟲之防除效果相比較更加優異。

[產業上之利用可能性]

如以上說明，本發明尤其在動物寄生性害蟲或衛生害蟲的防除領域中有極大貢獻。

發明專利說明書

(本申請書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：100124062

※申請日：100年07月07日

※IPC分類：

A01N 43/28 (2006.01)

A01N 25/00 (2006.01)

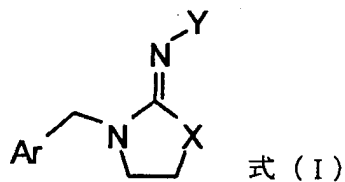
一、發明名稱：(中文/英文)

有害生物防除劑

二、中文發明摘要：

本發明係提供使用至少一種下述化學式(I)所示之亞胺衍生物的有害生物防除劑。

【化1】



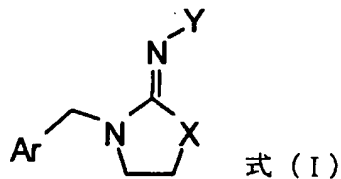
201216847

三、英文發明摘要：

七、申請專利範圍：

1. 一種有害生物防除劑，其特徵係含有一個以上下述化學式 (I) 所表示之亞胺衍生物而成，

【化1】



(式中，Ar 為環上可具有取代基的雜環基，X 為硫原子或 CH₂、NR，Y 為 COR₁、CONR₃R₄、CONHCOR₅、或 CO₂R₉，R 為氫原子或烷基，

Y 為 COR₁ 之場合，R₁ 為氫原子或 C1~C18 之烷基、C1~C18 之鹵素化烷基、C2~C18 之烯基、C2~C18 之鹵素化烯基、C2~C18 之炔基、C2~C18 之鹵素化炔基、取代或無取代 C6~C10 之芳基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C1~C8) 烷基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C2~C8) 烯基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C2~C8) 炔基、(C1~C4) 烷氧基 (C1~C5) 烷基、(C1~C4) 烷氧基 (C2~C5) 烯基、(C1~C4) 烷氧基 (C2~C5) 炔基、C1~C3 之烷氧基羰基、(C1~C3) 烷基磺醯基 (C1~C3) 烷基、(C1~C4) 烷基硫基 (C1~C5) 烷基、C3~C12 之取代或無取代環烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C1~C8) 烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C8) 烯基、3

員環~7員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C8) 炔基、氰 (C1~C3) 烷基、取代或無取代苯氧基 (C1~C8) 烷基、取代或無取代苯氧基 (C2~C8) 烯基、取代或無取代苯氧基 (C2~C8) 炔基、取代或無取代雜環 (C1~C8) 烷基、取代或無取代雜環 (C2~C8) 烯基、取代或無取代雜環 (C2~C8) 炔基、取代或無取代雜環氧基 (C1~C8) 烷基、取代或無取代雜環氧基 (C2~C8) 烯基、取代或無取代雜環氧基 (C2~C8) 炔基、呋喃基、嗎啉代基、降冰片烯基、金剛烷基、異硫基氰氧基甲基、玫瑰寧基、或取代或無取代之雜環或芳香環、(C1~C5) 烷基羰基胺基 (C1~C3) 烷基、(C1~C5) 烷基氧基羰基胺基氧基甲基、(C1~C5) 烷基氧基羰基胺基甲基、(C1~C5) 烷基羰基氧基甲基，

Y 為 CONR_3R_4 之場合， R_3 與 R_4 各自為氫原子或 C1~C5 之烷基、C1~C5 之鹵素化烷基、C2~C5 之烯基、C2~C5 之鹵素化烯基、C2~C5 之炔基、C2~C5 之鹵素化炔基、C1~C3 之烷氧基、烯基氧基、取代或無取代 C6~C10 之芳基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C1~C8) 烷基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C2~C8) 烯基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C2~C8) 炔基、(C1~C4) 烷氧基 (C1~C5) 烷基、(C1~C4) 烷氧基 (C2~C5) 烯基、(C1~C4) 烷氧基 (C2~C5) 炔基、C1~C3 之烷氧基羰基甲基、(C1~C4) 烷基硫基 (C1~C5) 烷基、C3~C12 之取代或無取代環烷基、3員環~7員環之取代或無取代雜環烷基

、取代或無取代吡啶基甲基、取代或無取代苯磺醯基、(C1~C5) 烷基胺基、取代或無取代苯基胺基、(C1~C5) 烷基羰基胺基、取代或無取代苯甲醯基胺基， NR_3R_4 亦可形成環，

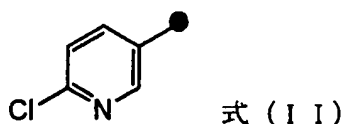
Y 為 $CONHCOR_5$ 之場合， R_5 為氫原子或 C1~C5 之烷基、C1~C5 之鹵素化烷基、C2~C5 之烯基、C2~C5 之鹵素化烯基、取代或無取代 C6~C10 之芳基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C1~C5) 烷基，

Y 為 CO_2R_9 之場合， R_9 為氫原子或 C1~C18 之烷基、C1~C18 之鹵素化烷基、C2~C18 之烯基、C2~C18 之鹵素化烯基、C2~C18 之炔基、C2~C18 之鹵素化炔基、取代或無取代 C6~C10 之芳基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C1~C8) 烷基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C2~C8) 烯基、取代或無取代 (C6~C10) 芳基 (C2~C8) 炔基、(C1~C4) 烷氧基 (C1~C5) 烷基、(C1~C4) 烷氧基 (C2~C5) 烯基、(C1~C4) 烷氧基 (C2~C5) 炔基、(C1~C4) 烷基硫基 (C1~C5) 烷基、三 (C1~C3 烷基) 矽烷基 (C1~C3) 烷基、C3~C12 之取代或無取代環烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C1~C8) 烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C8) 烯基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C8) 炔基、(C1~C3) 烷基磺醯基 (C1~C3) 烷基、取代或無取代苯氧基 (C1~C8) 烷基、取代或無取代苯氧基 (C2~C8) 烯基、取代或無取

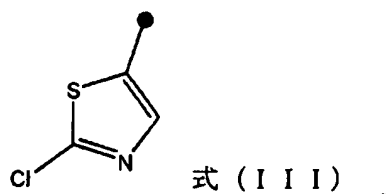
代苯氧基 (C2~C8) 炔基、取代或無取代雜環 (C1~C8) 烷基、取代或無取代雜環 (C2~C8) 烯基、取代或無取代雜環 (C2~C8) 炔基、取代或無取代雜環氧基 (C1~C8) 烷基、取代或無取代雜環氧基 (C2~C8) 烯基、取代或無取代雜環氧基 (C2~C8) 炔基、琥珀醯亞胺基、18-冠-6-甲基，又，以上之碳鏈可以鹵素取代)。

2.如請求項 1 記載之有害生物防除劑，其中，上述化學式 (I) 中，Ar 以下述化學式 (II) 或 (III) 表示，

【化2】



【化3】



3.如請求項 1 或 2 記載之有害生物防除劑，其中，

上述化學式 (I) 中，X 為硫原子，Y 為 COR₁ 或 CO₂R₉，

Y 為 COR₁ 之場合，R₁ 為 C1~C4 鹵素化烷基、C2~C6 烯基、C3~C6 炔基、取代或無取代苯基 (C1~C4) 烷基、取代或無取代苯基 (C2~C3) 烯基、(C1~C2) 烷氧基 (C1~C3) 烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C1~C3) 烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (

C1~C3) 烯基、取代或無取代雜環 (C1~C3) 烷基、取代或無取代雜環 (C2~C3) 烯基、

Y 爲 CO_2R_9 之場合， R_9 爲 C1~C6 之鹵素化烷基、較佳爲 C3~C4 之鹵素化烷基、C3~C6 烯基、較佳爲 C5~C6 烯基、C3~C6 炔基、較佳爲 C3~C4 炔基、取代或無取代苯基 (C1~C4) 烷基、取代或無取代苯基 (C1~C4) 烯基、較佳爲取代或無取代苯基 (C2~C4) 烷基、取代或無取代苯基 (C2~C4) 烯基、甲氧基 (C3~C4) 烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C1~C3) 烷基、較佳爲 3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C3) 烷基、取代或無取代雜環 (C2~C3) 烷基。

4.如請求項 1 或 2 記載之有害生物防除劑，其中，

上述化學式 (I) 中，X 爲硫原子，Y 爲 COR_1 或 CO_2R_9 ，

Y 爲 COR_1 之場合， R_1 爲 C1~C3 鹵素化烷基、C4~C6 烯基、C4~C6 炔基、取代苯基 (C2~C4) 烷基、取代或無取代苯基 (C2~C3) 烯基、(C1~C2) 烷氧基 (C1~C3) 烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C3) 烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C3) 烯基、取代或無取代雜環 (C2~C3) 烷基、取代或無取代雜環 (C2~C3) 烯基、

Y 爲 CO_2R_9 之場合， R_9 爲 C3~C4 之鹵素化烷基、C5~C6 烯基、C3~C4 炔基、取代或無取代苯基 (C2~C4) 烷基、取代或無取代苯基 (C2~C4) 烯基、甲氧基 (

C3~C4) 烷基、3 員環~7 員環之取代或無取代雜環烷基 (C2~C3) 烷基、取代或無取代雜環 (C2~C3) 烷基。

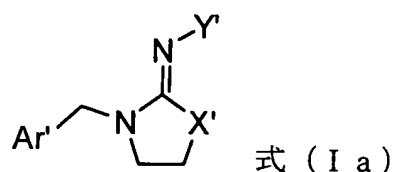
5. 如請求項 1 記載之有害生物防除劑，其中，上述化學式 (I) 所表示之亞胺衍生物為以下表所示之化合物，

[表1]

化合物編號	Y	X	Ar	化合物編號	Y	X	Ar
6	CO-phenyl	S	(II)	230	COCH ₂ OCOMe	S	(II)
42	COOMe	S	(II)	233	COCH ₂ ONHCOOEt	S	(II)
43	COOC ₃ H _{7-n}	S	(II)	240	COCF ₃	S	(II)
44	COOC ₃ H _{7-i}	S	(II)	241	COCF ₃	S	(III)
45	COOCH ₂ CH ₂ Cl	S	(II)	244	CO-3-methoxyphenyl	S	(II)
57	COPh	S	(III)	251	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ NO ₂	S	(II)
61	CHO	S	(II)	255	COOCH ₂ CH ₂ morpholinyl	S	(II)
72	COMe	S	(II)	267	CO-3-methylphenyl	S	(II)
76	COCHF ₂	S	(II)	268	CO-2-fluorophenyl	S	(II)
81	COCH ₂ CH ₂ OMe	S	(II)	292	CO-2-fluorophenyl	S	(III)
83	COCH=CH ₂	S	(II)	299	CO-phenyl	S	4,5-dichloro-3-pyridyl
106	CONHOMe	S	(II)	302	CO-phenyl	S	4-bromo-3-pyridyl
107	CONHOEt	S	(II)	303	COOCH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(II)
113	COOEt	S	(II)	308	COCH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(II)
114	COOCH ₂ CH ₂ F	S	(II)	309	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(II)
115	COOCH ₂ CH ₂ F ₂	S	(II)	313	COCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ C≡CH	S	(III)
122	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ F	S	(II)	326	COCH ₂ (2-tetrahydrofuranlyl)	S	(II)
123	COOCH(CH ₂ F) ₂	S	(II)	328	GOCH ₂ CH ₂ (2-thienyl)	S	(II)
124	COOCH(Me)CF ₃	S	(II)	329	COOCH ₂ CH ₂ (2-tetrahydrofuranlyl)	S	(II)
125	COOCH(CF ₃) ₂	S	(II)	336	COOCH ₂ CH ₂ (2-tetrahydrofuranlyl)	S	(II)
128	COO-n-butyl	S	(II)	337	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-furanlyl)	S	(II)
132	COOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ F	S	(II)	338	COOCH ₂ CH ₂ (3-tetrahydrofuranlyl)	S	(II)
134	COOCH ₂ CF ₂ CF ₂ CF ₃	S	(II)	341	GO-CH ₂ CH ₂ (3-furanlyl)	S	(II)
135	COOCH ₂ CH=OMe ₂	S	(II)	343	GOCH ₂ CH ₂ (4-methoxyphenyl)	S	(II)
139	COO-CH ₂ -cyclopropyl	S	(II)	345	GOCH ₂ CH ₂ (3,5-dimethoxyphenyl)	S	(II)
140	COOCH ₂ -2-oxiranyl	S	(II)	349	GOOCH ₂ CH ₂ CH ₂ (3-furanlyl)	S	(II)
141	COO-cyclobutyl	S	(II)	351	GOO-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (3-tetrahydrofuranlyl)	S	(II)
144	COOCH ₂ -3-tetrahydrofuranlyl	S	(II)	352	GOOCH ₂ CH ₂ (2-thienyl)	S	(II)
145	COOCH ₂ -(2,2-dimethyl-1,3-dioxolan-4-yl)	S	(II)	354	GOOCH ₂ CH ₂ (3-thienyl)	S	(II)
155	COCH ₂ -3-thienyl	S	(II)	355	GOCH ₂ CH ₂ -(benzo[d][1,3]dioxol-5-yl)	S	(II)
167	COO-iso-propyl	S	(II)	358	GOCH ₂ CH ₂ (3-methoxyphenyl)	S	(II)
171	COOCH ₂ C≡CH	S	(II)	359	GOOCH ₂ CH ₂ (2-furanlyl)	S	(II)
198	CO-4-t-butylphenyl	S	(III)	366	GOOCH ₂ (2-thienyl)	S	(II)
211	COO-n-pentyl	S	(II)	374	GOCH ₂ OCH ₂ C≡CH	S	(II)
213	CO-2,2-difluorocyclopropyl	S	(II)	430	GOCH ₂ OCH ₂ (2-furanlyl)	S	(II)
216	COCH ₂ CH ₂ CF ₃	S	(II)	431	GOCH ₂ OCH ₂ (3-furanlyl)	S	(II)
226	COO-n-hexyl	S	(II)				
227	GOOCH ₂ t-Bu	S	(II)				
228	COO-CH ₂ -Crownether(18-C-6)	S	(II)				

6. 一種下式 (Ia) 所示之化合物，

【化4】



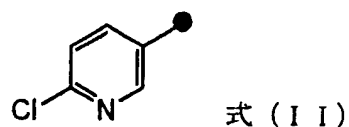
(式中，Ar'為環上可具有取代基的雜環基，X'為硫原子，Y'為COR₁'、或CO₂R₉'，

Y為COR₁'之場合，R₁'為取代苯基(C₂~C₄)烷基、3員環~7員環之取代或無取代雜環烷基(C₂~C₃)烷基、取代或無取代雜環(C₂~C₃)烷基、取代或無取代(C₁~C₄)烷氧基甲基、3員環~7員環的雜環烷基、取代或無取代雜環，

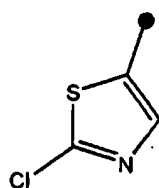
Y'為CO₂R₉'之場合，R₉'為3員環~7員環之取代或無取代雜環烷基(C₂~C₃)烷基、取代或無取代雜環(C₂~C₃)烷基)。

7.如請求項6記載之化合物，其中，上述化學式(Ia)中，Ar'以下述化學式(II)或(III)表示，

【化5】



【化6】



式 (I I I) 。

8.如請求項 1~5 記載之有害生物防除劑，其中，有害生物為動物寄生性害蟲。

9.如請求項 1~5 記載之有害生物防除劑，其中，有害生物為動物寄生性蟬。

10.一種有害生物之防除方法，其特徵係以請求項 1~5、請求項 9 中任一項記載之有害生物防除劑之有效量進行處理而成。

四、指定代表圖：

(一) 本案指定代表圖為：無

(二) 本代表圖之元件符號簡單說明：無

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：無