

國 籍：(中文/英文)

1. 法 國 / French
2. 瑞 士 / Swiss
3. 瑞 士 / Swiss
4. 瑞 典 / Swedish
5. 義大利 / Italian
6. 奧地利 / Austrian

四、聲明事項：

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

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

英國、2004.6.28.、0414438.2

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係有關哌啶衍生物、有關其製備方法、有關含其之殺蟲、殺蟎、殺軟體動物和殺線蟲組成物及有關使用其對抗和控制昆蟲、蟎、軟體動物(mollusc)和線蟲有害生物之方法。

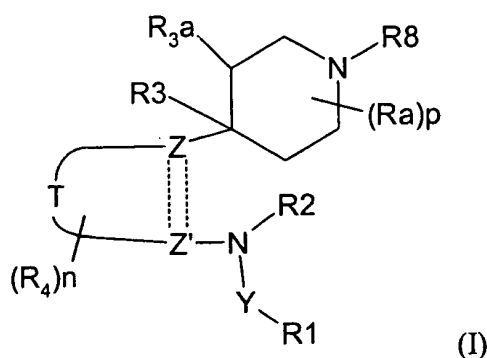
【先前技術】

具有抗真菌性質之哌啶衍生物描述在例如 EP 49717 中。

現今人驚訝地發現某些哌啶類具有殺蟲性質。

【發明內容】

本發明因此提供一種對抗和控制昆蟲、蟎、線蟲或軟體動物之方法，其包含將殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量之式(I)化合物施用至有害生物、至有害生物之區域或至易受有害生物侵襲之植物：



Y 為單鍵、C=O、C=S 或 S(O)_m，其中 m 為 0、1 或 2；

該環

視需要地經一或二個 C_{1-6} 烷基取代； R^{15} 為 H、視需要地經取代之烷基、視需要地經取代之烷氧基、視需要地經取代之芳基、視需要地經取代之芳氧基、視需要地經取代之雜芳基、視需要地經取代之雜芳氧基或 $NR^{19}R^{20}$ ； R^{16} 、 R^{17} 和 R^{18} 各自獨立地為 H 或低級烷基； R^{19} 和 R^{20} 獨立地為視需要地經取代之烷基、視需要地經取代之芳基或視需要地經取代之雜芳基；

R^2 為 H、羥基、視需要地經取代之烷氧基或視需要地經取代之烷基；或 R^1 和 R^2 與 Y 基和 N 一起形成 5-或 6-員雜環，其可視需要地包含一個選自 O、N 或 S 之進一步雜原子及其可視需要地經 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基或鹵素取代；

R^3 為 H、OH、鹵素或視需要地經取代之 C_{1-8} 烷基；

R^{3a} 為 H 或 R^3 和 R^{3a} 一起形成一鍵；

R^4 各自獨立地為鹵素、硝基、氰基、視需要地經取代之 C_{1-8} 烷基、視需要地經取代之 C_{2-6} 烯基、視需要地經取代之 C_{2-6} 炔基、視需要地經取代之烷氧羰基、視需要地經取代之烷羰基、視需要地經取代之烷胺羰基、視需要地經取代之二烷胺羰基、視需要地經取代之 C_{3-7} 環烷基、視需要地經取代之芳基、視需要地經取代之雜芳基、視需要地經取代之雜環基、視需要地經取代之烷氧基、視需要地經取代之芳氧基、視需要地經取代之雜芳氧基、視需要地經取代之烷硫基或 $R^{21}R^{22}N$ ，其中 R^{21} 和 R^{22} 獨立地為氫、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-7} 環烷基、 C_{3-6} 烯基、 C_{3-6} 炔基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-4})烷基、 C_{2-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧羰基

或 R^{21} 和 R^{22} 與他們所連接之 N 原子一起形成五、六或七-員雜環，其可包含一或二個選自 O、N 或 S 之進一步雜原子和其可視需要地經一或二個 C_{1-6} 烷基取代，或 2 個相鄰的 R^4 基與他們所連接之碳原子一起形成 4、5、6 或 7 員碳環或雜環，其可視需要地經鹵素取代；n 為 0、1、2、3 或 4；

R^8 為視需要地經取代之烷基、視需要地經取代之烯基、視需要地經取代之炔基、視需要地經取代之環烷基、視需要地經取代之芳基、視需要地經取代之烷氧基、視需要地經取代之芳氧基、視需要地經取代之烷氧羰基、視需要地經取代之烷羰基或視需要地經取代之烯羰基；

R_a 各自獨立地為鹵素、羥基、氰基、視需要地經取代之 C_{1-8} 烷基、視需要地經取代之 C_{2-6} 烯基、視需要地經取代之 C_{2-6} 炔基、視需要地經取代之烷氧羰基、視需要地經取代之烷羰基、視需要地經取代之烷胺羰基、視需要地經取代之二烷胺羰基、視需要地經取代之 C_{3-7} 環烷基、視需要地經取代之芳基、視需要地經取代之雜芳基、視需要地經取代之雜環基、視需要地經取代之烷氧基、視需要地經取代之芳氧基、視需要地經取代之雜芳氧基、視需要地經取代之烷硫基、視需要地經取代之芳硫基或 $R^{23}R^{24}N$ ，其中 R^{23} 和 R^{24} 獨立地為氫、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-7} 環烷基、 C_{3-6} 烯基、 C_{3-6} 炔基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-4})烷基、 C_{2-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧羰基或 R^{23} 和 R^{24} 與他們所連接之 N 原子一起形成五、六或七-員雜環，其可包含一或二

個選自 O、N 或 S 之進一步雜原子和其可視需要地經一或二個 C_{1-6} 烷基取代，或二個連接至相同碳原子之 Ra 基為 $=O$ 、 $=S$ 、 $=NRb$ 、 $=CRcRd$ ，其中 Rb、Rc 和 Rd 獨立地為 H 或視需要地經取代之烷基；p 為 0、1、2、3 或 4 或其鹽或 N-氧化物。

【實施方式】

式(I)之化合物可存在不同幾何或光學異構物或互變異構形式。本發明涵蓋所有該等異構物和互變異構物及其所有比例之混合物以及同位素形式例如氘化化合物。

各烷基部分單獨或作為較大基(例如烷氧基、烷氧羰基、烷羰基、烷胺羰基、二烷胺羰基)之部分為直鏈或支鏈且為例如甲基、乙基、正-丙基、正-丁基、正-戊基、正-己基、異-丙基、正-丁基、二級-丁基、異-丁基、三級-丁基或新-戊基。烷基適合為 C_1 到 C_{12} 烷基，但較佳為 C_1 - C_{10} ，更佳 C_1 - C_8 ，甚至更佳 C_1 - C_6 和最佳 C_1 - C_4 烷基。

當存在時，在烷基部分(單獨或作為較大基例如烷氧基、烷氧羰基、烷羰基、烷胺羰基、二烷胺羰基之部分)上的視需要之取代基包括一或多個之鹵素、硝基、氰基、NCS-、 C_{3-7} 環烷基(其本身視需要地經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、 C_{5-7} 環烯基(其本身視需要地經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、羥基、 C_{1-10} 烷氧基、 C_{1-10} 烷氧基(C_{1-10})烷氧基、三(C_{1-4})烷基甲矽烷基(C_{1-6})烷氧基、 C_{1-6} 烷氧羰基(C_{1-10})烷氧基、 C_{1-10} 鹵烷氧基、芳基(C_{1-4})-烷氧基(其中芳基視需要地經取代)、 C_{3-7} 環烷氧基(其中環烷基視需要地經 C_{1-6} 烷基或鹵素取

代)、 C_{2-10} 烯氧基、 C_{2-10} 炔氧基、SH、 C_{1-10} 烷硫基、 C_{1-10} 鹵烷硫基、芳基(C_{1-4})烷硫基(其中芳基視需要地經取代)、 C_{3-7} 環烷硫基(其中環烷基視需要地經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、三(C_{1-4})烷基甲矽烷基(C_{1-6})烷硫基、芳硫基(其中芳基視需要地經取代)、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷磺醯基、 C_{1-6} 烷亞磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷亞磺醯基、芳磺醯基(其中芳基可視需要地經取代)、三(C_{1-4})烷基甲矽烷基、芳基二(C_{1-4})烷基甲矽烷基、(C_{1-4})烷基二芳基甲矽烷基、三芳基甲矽烷基、 C_{1-10} 烷羰基、 HO_2C 、 C_{1-10} 烷氧羰基、胺羰基、 C_{1-6} 烷胺羰基、二(C_{1-6} 烷基)胺羰基、N-(C_{1-3} 烷基)-N-(C_{1-3} 烷氧基)胺羰基、 C_{1-6} 烷羰氧基、芳羰氧基(其中芳基視需要地經取代)、二(C_{1-6})烷胺羰氧基、肟類例如 =NO 烷基、=NO 鹵烷基和 =NO 芳基(其本身視需要地經取代)、芳基(其本身視需要地經取代)、雜芳基(其本身視需要地經取代)、雜環基(其本身視需要地經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、芳氧基(其中芳基視需要地經取代)、雜芳氧基(其中雜芳基視需要地經取代)、雜環氧基(其中雜環基視需要地經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、胺基、 C_{1-6} 烷胺基、二(C_{1-6})烷胺基、 C_{1-6} 烷羰胺基、N-(C_{1-6})烷羰基-N-(C_{1-6})烷胺基、 C_{2-6} 烯羰基、 C_{2-6} 炔羰基、 C_{3-6} 烯氧羰基、 C_{3-6} 炔氧羰基、芳氧羰基(其中芳基視需要地經取代)和芳羰基(其中芳基視需要地經取代)。

烯基和炔基部分可於直鏈或支鏈之形式，和烯基部分，其中適當的話，可為(E)-或(Z)-構形。例子為乙烯基、烯丙基及丙炔基。

當存在時，在烯基或炔基上的視需要之取代基包括給予於上述烷基部分的視需要之取代基。

在本說明書之上下文中鹼基為視需要地經取代之 C_{1-6} 烷羰基(例如乙鹼基)、視需要地經取代之 C_{2-6} 烯羰基、視需要地經取代之 C_{2-6} 炔羰基、視需要地經取代之芳羰基(例如苯甲鹼基)或視需要地經取代之雜芳羰基。

鹵素為氟、氯、溴或碘。

鹵烷基為經一或多個相同或不同鹵素原子取代之烷基和為例如 CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_3CH_2 或 CHF_2CH_2 。

在本說明書之上下文中術語"芳基"、"芳族環"和"芳族環系統"係指一種可為單-、二-或三環之環系統。該等環之例子包括苯基、萘基、蒽基、茚基或菲基，較佳芳基為苯基。此外，術語"雜芳基"、"雜芳族環"或"雜芳族環系統"係指一種包含至少一個雜原子和由單一環或由二或多個稠合環所組成之芳族環系統。較佳地單一環將包含高達三個和二環系統包含高達四個雜原子，其較佳選自氮、氧和硫。該等基之例子包括呋喃基、噻吩基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、噁唑基、異噁唑基、噻唑基、異噻唑基、1,2,3-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、吡啶基、嘧啶基、嗒吡基、吡吡基、1,2,3-三吡基、1,2,4-三吡基、1,3,5-三吡基、苯并呋喃基、苯并異呋喃基、苯并噻吩基、苯并異噻吩基、吲哚基、異吲哚基、吲唑基、苯并噻唑基、苯并異

術語雜環和雜環基係指包括一或多個(較佳一或二個)選自 O、S 和 N 之雜原子的包含高達 10 個原子之非芳族環，該等環之例子包括 1,3-二噁茂烷(dioxolane)、四氫呋喃和嗎福啉基。

當存在時，在雜環基上的視需要之取代基包括 C₁₋₆ 烷基和 C₁₋₆ 鹵烷基以及該等給予於上述烷基部分的視需要之取代基。

環烷基包括環丙基、環戊基和環己基。

環烯基包括環戊烯基和環己烯基。

當存在時，環烷基或環烯基上的視需要之取代基包括 C₁₋₃ 烷基以及該等給予於上述烷基部分的視需要之取代基。

碳環包括芳基、環烷基及環烯基。

當存在時，在芳基或雜芳基上的視需要之取代基係獨立地選自鹵素、硝基、氰基、NCS-、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 鹵烷基、C₁₋₆ 烷氧基-(C₁₋₆)烷基、C₂₋₆ 烯基、C₂₋₆ 鹵烯基、C₂₋₆ 炔基、C₃₋₇ 環烷基(其本身視需要地經 C₁₋₆ 烷基或鹵素取代)、C₅₋₇ 環烯基(其本身視需要地經 C₁₋₆ 烷基或鹵素取代)、

經基、 C_{1-10} 烷氧基、 C_{1-10} 烷氧基(C_{1-10})烷氧基、三(C_{1-4})烷基-甲矽烷基(C_{1-6})烷氧基、 C_{1-6} 烷氧羰基(C_{1-10})烷氧基、 C_{1-10} 鹵烷氧基、芳基(C_{1-4})烷氧基(其中芳基視需要地經鹵素或 C_{1-6} 烷基取代)、 C_{3-7} 環烷氧基(其中環烷基視需要地經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、 C_{2-10} 烯氧基、 C_{2-10} 炔氧基、SH、 C_{1-10} 烷硫基、 C_{1-10} 鹵烷硫基、芳基(C_{1-4})烷硫基 C_{3-7} 環烷硫基(其中環烷基視需要地經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、三(C_{1-4})-烷基甲矽烷基(C_{1-6})烷硫基、芳硫基、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷磺醯基、 C_{1-6} 烷亞磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷亞磺醯基、芳磺醯基、三(C_{1-4})烷基甲矽烷基、芳基二(C_{1-4})-烷基甲矽烷基、(C_{1-4})烷基二芳基甲矽烷基、三芳基甲矽烷基、 C_{1-10} 烷羰基、 HO_2C 、 C_{1-10} 烷氧羰基、胺羰基、 C_{1-6} 烷胺羰基、二(C_{1-6} 烷基)-胺羰基、N-(C_{1-3} 烷基)-N-(C_{1-3} 烷氧基)胺羰基、 C_{1-6} 烷羰氧基、芳羰氧基、二(C_{1-6})烷胺羰氧基、芳基(其本身視需要地經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、雜芳基(其本身視需要地經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、雜環基(其本身視需要地經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、芳氧基(其中芳基視需要地經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、雜芳氧基(其中雜芳基視需要地經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、雜環氧基(其中雜環基視需要地經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、胺基、 C_{1-6} 烷胺基、二(C_{1-6})烷胺基、 C_{1-6} 烷羰胺基、N-(C_{1-6})烷羰基-N-(C_{1-6})烷胺基、芳羰基，(其中芳基本身視需要地經鹵素或 C_{1-6} 烷基取代)或在芳基或雜芳基系統上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素或 C_{1-6} 烷基取代。芳基

或雜芳基之進一步取代基包括芳羰胺基(其中芳基經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、 (C_{1-6}) 烷氧羰胺基 (C_{1-6}) 烷氧羰基-N- (C_{1-6}) 烷胺基、芳氧羰胺基(其中芳基經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、芳氧羰基-N- (C_{1-6}) 烷胺基, (其中芳基經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、芳磺醯胺基(其中芳基經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、芳磺醯基-N- (C_{1-6}) 烷胺基(其中芳基經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、芳基-N- (C_{1-6}) 烷胺基(其中芳基經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、芳胺基(其中芳基經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、雜芳胺基(其中雜芳基經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、雜環胺基(其中雜環基經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、胺羰胺基、 C_{1-6} 烷胺羰胺基、二 (C_{1-6}) 烷胺羰胺基、芳胺羰胺基(其中芳基經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、芳基-N- (C_{1-6}) 烷胺羰胺基(其中芳基經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、 C_{1-6} 烷胺羰基-N- (C_{1-6}) 烷胺基、二 (C_{1-6}) 烷胺羰基-N- (C_{1-6}) 烷胺基、芳胺羰基-N- (C_{1-6}) 烷胺基(其中芳基經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)及芳基-N- (C_{1-6}) 烷胺羰基-N- (C_{1-6}) 烷胺基(其中芳基經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)。

對於經取代之苯基部分、雜環基及雜芳基, 最好一或多個取代基獨立地選自鹵素、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{1-6} 烷硫基、 C_{1-6} 鹵烷硫基、 C_{1-6} 烷亞磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷亞磺醯基、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 鹵烷磺醯基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 鹵烯基、 C_{2-6} 炔基、 C_{3-7} 環烷基、硝基、氰基、 CO_2H 、 C_{1-6} 烷羰基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 $R^{25}R^{26}N$ 或 $R^{27}R^{28}NC(O)$; 其中 R^{25} 、 R^{26} 、 R^{27} 和 R^{28} 獨立地為氫或 C_{1-6} 烷基。進一步較佳取代基為芳基

和雜芳基。

鹵烯基為經一或多個相同或不同鹵素原子取代之烯基。

應了解二烷基胺基取代基包括該等其中二烷基與他們所連接之 N 原子一起形成五、六或七-員雜環(其可包含一或二個選自 O、N 或 S 之進一步雜原子和其視需要地經一或二個獨立地選自 (C₁₋₆) 烷基取代) 者。當雜環由連接一個 N 原子上之二個基形成時，所產生之環適合為吡咯啉、哌啉、硫嗎福啉和嗎福啉，其各可經一或二個獨立地選自 (C₁₋₆) 烷基取代。

較佳地在烷基部分上的視需要之取代基包括一或多個之鹵素、硝基、氰基、HO₂C、C₁₋₁₀ 烷氧基(其本身視需要地經 C₁₋₁₀ 烷氧基取代)、芳基(C₁₋₄)烷氧基、C₁₋₁₀ 烷硫基、C₁₋₁₀ 烷羰基、C₁₋₁₀ 烷氧羰基、C₁₋₆ 烷胺羰基、二(C₁₋₆ 烷基)胺羰基、(C₁₋₆) 烷羰氧基、視需要地經取代之苯基、雜芳基、芳氧基、芳羰氧基、雜芳氧基、雜環基、雜環氧基、C₃₋₇ 環烷基(其本身視需要地經 (C₁₋₆) 烷基或鹵素取代)、C₃₋₇ 環烷氧基、C₅₋₇ 環烯基、C₁₋₆ 烷磺醯基、C₁₋₆ 烷亞磺醯基、三(C₁₋₄) 烷基甲矽烷基、三(C₁₋₄) 烷基甲矽烷基(C₁₋₆) 烷氧基、芳基二(C₁₋₄) 烷基甲矽烷基、(C₁₋₄) 烷基二芳基甲矽烷基和三芳基甲矽烷基。

較佳地在烯基或炔基上的視需要之取代基包括一或多個之鹵素、芳基和 C₃₋₇ 環烷基。

雜環基的較佳視需要之取代基為 C₁₋₆ 烷基。

(S)

較佳地環烷基的視需要之取代基包括鹵素、氰基和 C_{1-3} 烷基。

較佳地環烯基的視需要之取代基包括 C_{1-3} 烷基、鹵素和氰基。

T、Y、Ra、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^{3a} 、 R^4 、和 R^8 之較佳基在其任何組合中係如下所述，

較佳地 Y 為單鍵、C=O 或 C=S。

更佳地 Y 為單鍵或 C=O。

最佳地 Y 為 C=O。

較佳地 R^1 為氫、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 氰基烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-4})烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、雜芳基(C_{1-6})烷基(其中雜芳基可視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 烷亞磺醯基、 C_{1-6} 烷硫基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷羰胺基、芳羰基取代，或在雜芳基系統上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)、芳基(C_{1-6})烷基(其中芳基可視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 烷亞磺醯基、 C_{1-6} 烷硫基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷羰胺基、芳羰基取代，或在芳基系統上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)、 C_{1-6} 烷羰胺基(C_{1-6})烷基、芳基(其可視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{1-6} 烷磺

醯基、 C_{1-6} 烷亞磺醯基、 C_{1-6} 烷硫基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷羰胺基、芳羰基取代，或在芳基系統上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)、雜芳基(其可視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 烷亞磺醯基、 C_{1-6} 烷硫基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷羰胺基、芳羰基取代，或在雜芳基系統上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、苯氧基(其中苯基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、NO₂、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、雜芳氧基(視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、雜環氧基(視需要地經鹵基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、氰基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 炔基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{5-7} 環烯基、雜環基(視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、 C_{1-6} 烷硫基、 C_{1-6} 鹵烷硫基或 $NR^{13}R^{14}$ ，其中 R^{13} 和 R^{14} 獨立地為氫、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、苯基(其可視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、NO₂、芳基、雜芳基、胺基、二烷胺基或 C_{1-4} 烷氧羰基取代)、苯基(C_{1-6})烷基(其中苯基可視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、NO₂、芳基、雜芳基、

胺基、二烷胺基、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 烷氧羰基取代，或在苯基環上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)、雜芳基(C_{1-6}) 烷基(其中雜芳基可視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 烷亞磺醯基、 C_{1-6} 烷硫基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷羰胺基、芳羰基取代，或在雜芳基系統上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)或雜芳基(其可視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、 C_{1-4} 烷氧羰基 C_{1-6} 烷羰胺基、苯氧羰胺基(其中苯基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、胺基、 C_{1-6} 烷胺基或苯胺基(其中苯基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代))。

更佳地 R^1 為 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6}) 烷基、雜芳基(C_{1-3})烷基(其中雜芳基可視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 烷氧羰基取代，或在雜芳基系統上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)、苯基(C_{1-3})烷基(其中苯基可視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基、

二烷基胺基、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 烷氧羰基取代，或在苯基環上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)、苯基(其可視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基、二烷基胺基、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 烷氧羰基取代，或在苯基環上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)、雜芳基(其可視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 烷氧羰基取代，或在雜芳基系統上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{2-6} 烯基、雜環基(視需要地經鹵基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、 C_{1-6} 烷硫基、 C_{1-6} 鹵烷硫基或 $NR^{13}R^{14}$ ，其中 R^{13} 和 R^{14} 獨立地為氫、 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、 C_{2-6} 烷羰基、苯羰基，(其中苯基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷基胺基取代)、苯基(C_{1-3})烷基(其中苯基可視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基、二烷基胺基、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 烷氧羰基取代，或在苯基環上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)或雜芳基(C_{1-3})烷基(其中雜芳

基可視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 烷亞磺醯基、 C_{1-6} 烷硫基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷羰胺基、芳羰基取代，或在雜芳基系統上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)。

甚至更佳地 R^1 為 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、雜芳基(C_{1-3}) 烷基(其中雜芳基可視需要地經鹵基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基取代和其中雜芳基為噻唑、吡啶、嘧啶、吡啶或嗒吡環)、雜芳基(視需要地經鹵基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基取代和其中雜芳基為吡啶、嘧啶、2,1,3-苯并噁二唑、吡啶或嗒吡環)、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷胺基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷胺基或雜芳基(C_{1-3})烷胺基(其中雜芳基可視需要地經鹵基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基取代和其中雜芳基為噻唑、吡啶、嘧啶、吡啶或嗒吡環)。

最佳地 R^1 為吡啶基(視需要地經鹵基、 C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 鹵烷基取代)，特別是鹵基取代之吡啶基。

最好 R^2 為氫、羥基、 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 鹵烷基。

更佳地 R^2 為氫、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基。

甚至更佳地 R^2 為氫或 C_{1-4} 烷基。

仍更佳地 R^2 獨立地為氫或甲基。

最佳地 R^2 為氫。

最好 R^3 為氫、羥基、鹵素、 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 鹵烷基。

更佳地 R^3 為氫、羥基、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基。

甚至更佳地 R^3 為氫或 C_{1-4} 烷基。

仍更佳地 R^3 獨立地為氫或甲基。

最佳地 R^3 為氫。

R^{3a} 為氫或 R^3 和 R^{3a} 一起形成一雙鍵。

較佳地 R^4 各自獨立地為鹵素、氰基、 C_{1-8} 烷基、 C_{1-8} 鹵烷基、氰基烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-6})烷基、 C_{5-6} 環烯基(C_{1-6})烷基、 C_{3-6} 烯氧基(C_{1-6})烷基、 C_{3-6} 炔氧基(C_{1-6})烷基、芳氧基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 羧烷基、 C_{1-6} 烷羧基(C_{1-6})烷基、 C_{2-6} 烯羧基(C_{1-6})烷基、 C_{2-6} 炔羧基(C_{1-6})-烷基、 C_{1-6} 烷氧羧基(C_{1-6})烷基、 C_{3-6} 烯氧羧基(C_{1-6})烷基、 C_{3-6} 炔氧羧基(C_{1-6})烷基、芳氧羧基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷硫基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷亞磺基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷磺基(C_{1-6})烷基、胺羧基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷胺羧基(C_{1-6})烷基、二(C_{1-6})烷胺羧基(C_{1-6})烷基、苯基(C_{1-4})烷基(其中苯基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、雜芳基(C_{1-4})烷基(其中雜芳基視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、雜環基(C_{1-4})烷基(其中雜環基視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、 C_{2-6} 烯基、胺羧基(C_{2-6})烯基、 C_{1-6} 烷胺羧基(C_{2-6})烯基、二(C_{1-6})烷胺羧基(C_{2-6})烯基、苯基(C_{2-4})-烯基，(其中苯基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取

代)、 C_{2-6} 炔基、三甲基甲矽烷基(C_{2-6})炔基、胺羰基(C_{2-6})炔基、 C_{1-6} 烷胺羰基(C_{2-6})炔基、二(C_{1-6})烷胺羰基(C_{2-6})炔基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 C_{3-7} 環烷基、 C_{3-7} 鹵環烷基、 C_{3-7} 氰基環烷基、 C_{1-3} 烷基(C_{3-7})-環烷基、 C_{1-3} 烷基(C_{3-7})鹵環烷基、苯基(視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、雜芳基(視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、雜環基(其中雜環基視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)，或 2 個相鄰基 R^4 與他們所連接之碳原子一起形成 4、5、6 或 7 員碳環或雜環，其可視需要地經鹵素、 C_{1-8} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、苯氧基(視需要地鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、雜芳氧基(視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、 C_{1-8} 烷硫基或 $R^{19}R^{20}N$ 取代，其中 R^{19} 和 R^{20} 獨立地為氫、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-7} 環烷基、 C_{3-6} 烯基、 C_{3-6} 炔基、 C_{2-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧羰基或 R^{19} 和 R^{20} 與他們所連接之 N 原子一起形成五、六或七-員雜環，其可包含一或二個選自 O、N 或 S 之進一步雜原子和其可視需要地經一或二個 C_{1-6} 烷基取代；n 為 0、1、2 或 3。

更佳地 R^4 各自獨立地為鹵素、氰基、 C_{1-8} 烷基、 C_{1-8} 鹵烷基、 C_{1-8} 氰基烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、 C_{2-6} 炔基、三甲基甲矽烷基(C_{2-6})炔基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 C_{3-7} 環烷基、

C_{1-3} 烷基 (C_{3-7}) 環烷基、苯基 (視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、雜環基 (視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、 C_{1-8} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、苯氧基 (視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、雜芳氧基 (視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-3} 烷基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{1-3} 烷氧基或 C_{1-3} 鹵烷氧基取代)、二(C_{1-8}) 烷胺基，或 2 個相鄰基 R^4 與他們所連接之碳原子一起形成 4、5、6 或 7 員碳環或雜環，其可視需要地經鹵素取代； n 為 0、1、2 或 3。

甚至更佳地 R^4 各自獨立為鹵素、氰基、 C_{1-8} 烷基、 C_{1-8} 鹵烷基、 C_{1-8} 氰基烷基、 C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基、 C_{2-6} 炔基、雜環基 (視需要地經 C_{1-6} 烷基取代)、 C_{1-8} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、苯氧基 (視需要地經鹵基、氰基、 C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 鹵烷基取代)、雜芳氧基 (視需要地經鹵基、氰基、 C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 鹵烷基取代)、二(C_{1-8}) 烷胺基或 2 個相鄰基 R^4 與他們所連接之碳原子一起形成 4、5、6 或 7 員碳環或雜環，其可視需要地經鹵素取代； n 為 0、1、2 或 3。

仍更佳地 R^4 各自獨立地為氟基、氯基、溴基、氰基、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 氰基烷基或 C_{1-3} 烷氧基 (C_{1-3}) 烷基； n 為 0、1、2 或 3，較佳地 0、1 或 2。

最佳地 R^4 各自獨立地為氟基、氯基、溴基、 C_{1-4} 烷基

或 C_{1-4} 鹵烷基； n 為 1、2 或 3，較佳地 1 或 2。

較佳地 R^8 為 C_{1-10} 烷基、 C_{1-10} 鹵烷基、芳基(C_{1-6})烷基(其中芳基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、雜芳基(C_{1-6})烷基(其中雜芳基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、芳羰基-(C_{1-6})烷基(其中芳基可視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代和烷基可視需要地經芳基取代)、 C_{2-8} 烯基、 C_{2-8} 鹵烯基、芳基(C_{2-6})-烯基(其中芳基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基、 C_{1-6} 烷氧羰基取代，或二個相鄰取代基可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環)、雜芳基(C_{2-6})-烯基(其中雜芳基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基、 C_{1-6} 烷氧羰基取代，或二個相鄰取代基可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環)、 C_{2-6} 炔基、苯基(C_{2-6})炔基(其中苯基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、 C_{3-7} 環烷基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷羰基、 C_{1-6} 鹵烷羰基或芳基(C_{2-6})烯羰基(其中芳基可視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、

NO₂、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)，或 -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵，其中 *z* 為 1 或 2，R⁵¹ 和 R⁵² 各自獨立地為 H、鹵基或 C₁₋₂ 烷基、R⁵³ 和 R⁵⁴ 各自獨立地為 H、鹵素、C₁₋₄ 烷基或 C₁₋₄ 鹵烷基和 R⁵⁵ 為視需要地經取代之芳基或視需要地經取代之雜芳基。

更佳地 R⁸ 為苯基(C₁₋₄)烷基(其中苯基視需要地經鹵素、C₁₋₄ 烷基、C₁₋₄ 烷氧基、C₁₋₄ 鹵烷基、C₁₋₄ 鹵烷氧基、CN、NO₂、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、雜芳基(C₁₋₆)烷基(其中雜芳基視需要地經鹵素、C₁₋₄ 烷基、C₁₋₄ 烷氧基、C₁₋₄ 鹵烷基、C₁₋₄ 鹵烷氧基、CN、NO₂、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、苯基(C₂₋₆)烯基(其中苯基視需要地經鹵素、C₁₋₄ 烷基、C₁₋₄ 烷氧基、C₁₋₄ 鹵烷基、C₁₋₄ 鹵烷氧基、CN、NO₂、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、雜芳基(C₂₋₆)烯基(其中雜芳基視需要地經鹵素、C₁₋₄ 烷基、C₁₋₄ 烷氧基、C₁₋₄ 鹵烷基、C₁₋₄ 鹵烷氧基、CN、NO₂、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)或苯基(C₂₋₆)炔基(其中苯基視需要地經鹵素、C₁₋₄ 烷基、C₁₋₄ 烷氧基、C₁₋₄ 鹵烷基、C₁₋₄ 鹵烷氧基、CN、NO₂、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代，或 -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵，其中 *z* 為 1 或 2，R⁵¹ 和 R⁵² 各自獨立地為 H、鹵基或 C₁₋₂ 烷基、R⁵³ 和 R⁵⁴ 各自獨立地為 H、鹵素、C₁₋₄ 烷基或 C₁₋₄ 鹵烷基和 R⁵⁵ 為視需要地經取代之芳基或視需要地經取代之雜芳基。

最佳地 R⁸ 為 -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵，其中 *z* 為 1 或 2，較佳 1，R⁵¹ 和 R⁵² 各自獨立地為 H 或 C₁₋₂ 烷基，R⁵³

和 R^{54} 各自獨立地為 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基和 R^{55} 為經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代之苯基或經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代之雜芳基。

R^{51} 和 R^{52} 較佳為氫。

R^{53} 和 R^{54} 較佳為氫或鹵素，特別是氫。

R^{55} 較佳為經一至三個選自鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基的取代基取代之苯基。

較佳地 Ra 各自獨立地為鹵基、氰基、 C_{1-3} 烷基、羥基或二個 Ra 基與他們所連接之碳原子一起形成 $=O$ 、 $=S$ 、 $=NRb$ 、 $=CRcRd$ ，其中 Rb、Rc 和 Rd 獨立地為 H 或視需要地經取代之烷基；及 p 為 0、1 或 2。

更佳地 Ra 各自獨立地為氰基、甲基、羥基或二個 Ra 與他們所連接之碳原子一起形成羰基及 p 為 0、1 或 2。

最佳 p 為 0。

最好該環



為 6 員芳族環或為 5 或 6 員雜芳族環，其中該等非 Z 和 Z' 之環成員各自獨立地為 CH、S、N、 NR^4 、O 或 CR^4 ，

其先決條件為沒有超過一個 O 或 S 原子存在於環中。

更佳地該環



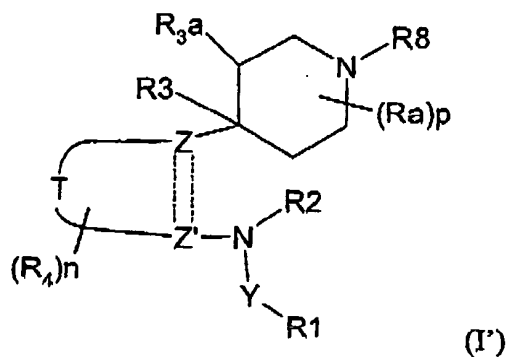
為苯、吡啶、嘧啶、吡嗪、噻吩、三嗪、吡咯、咪唑、喹啉、異喹啉、噻吩、吡唑、噁唑、噻唑、異噁唑、異噻唑、[1,2,3]三唑、[1,2,3]噁二唑或[1,2,3]噻二唑。

最佳地該環



為苯、吡啶、嘧啶、吡嗪、噻吩或吡唑環，特別是苯環。

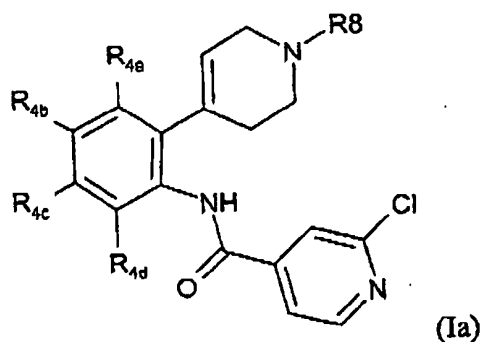
某些式(I)化合物為新穎的且如此形成本發明之進一步觀點。新穎化合物之一族為式 I' 之化合物，



其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^{3a} 、 R^4 、 R_a 、 T 、 Y 、 n 和 p 如式 I 之相關定義及 R^8 為 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ ，其中 z 為 1 或 2，較佳為 1， R^{51} 和 R^{52} 各自獨立地為 H 或 C_{1-2} 烷基， R^{53} 和 R^{54} 各自獨立地為 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基和 R^{55} 為經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代之苯基或經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代之雜芳基，或其鹽或 N-氧化物。

下表 I 至 LXXIII 中的化合物舉例說明本發明之化合物。

表 I 提供 897 個式 Ia 之化合物



其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 1

化合物編號	R ⁸	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{4c}	R ^{4d}
I-1	4-氯苯甲基	H	H	H	H
I-2	苯烯丙基	H	H	H	H
I-3	4-氯苯烯丙基	H	H	H	H
I-4	4-氯苯烯丙基	H	H	H	H
I-5	4-溴苯烯丙基	H	H	H	H
I-6	4-三氟甲基苯烯丙基	H	H	H	H
I-7	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	H	H	H
I-8	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	H	H	H
I-9	4-甲氧基苯烯丙基	H	H	H	H
I-10	4-乙氧基苯烯丙基	H	H	H	H
I-11	4-氟基苯烯丙基	H	H	H	H
I-12	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	H	H	H
I-13	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	H	H	H
I-14	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	H	H	H	H
I-15	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	H	H	H	H
I-16	3,5-二氟基-苯烯丙基	H	H	H	H
I-17	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	H	H	H
I-18	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	H	H	H
I-19	3-萘-2-基-烯丙基	H	H	H	H
I-20	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	H	H
I-21	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	H	H
I-22	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	H	H	H

I-23	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	H	H	H
I-24	4-氯苯甲基	H	F	H	H
I-25	苯烯丙基	H	F	H	H
I-26	4-氯苯烯丙基	H	F	H	H
I-27	4-氯苯烯丙基	H	F	H	H
I-28	4-溴苯烯丙基	H	F	H	H
I-29	4-三氟甲基苯烯丙基	H	F	H	H
I-30	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	F	H	H
I-31	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	F	H	H
I-32	4-甲氧基苯烯丙基	H	F	H	H
I-33	4-乙氧基苯烯丙基	H	F	H	H
I-34	4-氯基苯烯丙基	H	F	H	H
I-35	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	F	H	H
I-36	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	F	H	H
I-37	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	H	F	H	H
I-38	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	H	F	H	H
I-39	3,5-二氟基-苯烯丙基	H	F	H	H
I-40	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	F	H	H
I-41	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	F	H	H
I-42	3-萘-2-基-烯丙基	H	F	H	H
I-43	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	F	H	H
I-44	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	F	H	H
I-45	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	F	H	H
I-46	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	F	H	H

I-47	4-氯苯甲基	H	Cl	H	H
I-48	苯烯丙基	H	Cl	H	H
I-49	4-氯苯烯丙基	H	Cl	H	H
I-50	4-氯苯烯丙基	H	Cl	H	H
I-51	4-溴苯烯丙基	H	Cl	H	H
I-52	4-三氟甲基苯烯丙基	H	Cl	H	H
I-53	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	Cl	H	H
I-54	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	Cl	H	H
I-55	4-甲氧基苯烯丙基	H	Cl	H	H
I-56	4-乙氧基苯烯丙基	H	Cl	H	H
I-57	4-氟基苯烯丙基	H	Cl	H	H
I-58	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	Cl	H	H
I-59	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	Cl	H	H
I-60	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	H	Cl	H	H
I-61	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	H	Cl	H	H
I-62	3,5-二氟基-苯烯丙基	H	Cl	H	H
I-63	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	Cl	H	H
I-64	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	Cl	H	H
I-65	3-萘-2-基-烯丙基	H	Cl	H	H
I-66	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	H	H
I-67	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	H	H
I-68	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	Cl	H	H
I-69	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	Cl	H	H
I-70	4-氯苯甲基	H	H	F	H

I-71	苯烯丙基	H	H	F	H
I-72	4-氯苯烯丙基	H	H	F	H
I-73	4-氯苯烯丙基	H	H	F	H
I-74	4-溴苯烯丙基	H	H	F	H
I-75	4-三氟甲基苯烯丙基	H	H	F	H
I-76	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	H	F	H
I-77	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	H	F	H
I-78	4-甲氧基苯烯丙基	H	H	F	H
I-79	4-乙氧基苯烯丙基	H	H	F	H
I-80	4-氟基苯烯丙基	H	H	F	H
I-81	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	H	F	H
I-82	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	H	F	H
I-83	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	H	H	F	H
I-84	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	H	H	F	H
I-85	3,5-二氟基-苯烯丙基	H	H	F	H
I-86	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	H	F	H
I-87	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	H	F	H
I-88	3-萘-2-基-烯丙基	H	H	F	H
I-89	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	F	H
I-90	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	F	H
I-91	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	H	F	H
I-92	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	H	F	H
I-93	4-氯苯甲基	H	H	Cl	H
I-94	苯烯丙基	H	H	Cl	H

I-95	4-氯苯烯丙基	H	H	Cl	H
I-96	4-氯苯烯丙基	H	H	Cl	H
I-97	4-溴苯烯丙基	H	H	Cl	H
I-98	4-三氟甲基苯烯丙基	H	H	Cl	H
I-99	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	H	Cl	H
I-100	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	H	Cl	H
I-101	4-甲氧基苯烯丙基	H	H	Cl	H
I-102	4-乙氧基苯烯丙基	H	H	Cl	H
I-103	4-氟基苯烯丙基	H	H	Cl	H
I-104	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	H	Cl	H
I-105	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	H	Cl	H
I-106	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	H	H	Cl	H
I-107	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	H	H	Cl	H
I-108	3,5-二氟基-苯烯丙基	H	H	Cl	H
I-109	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	H	Cl	H
I-110	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	H	Cl	H
I-111	3-萘-2-基-烯丙基	H	H	Cl	H
I-112	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	Cl	H
I-113	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	Cl	H
I-114	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	H	Cl	H
I-115	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	H	Cl	H
I-116	4-氯苯甲基	Cl	Cl	H	H
I-117	苯烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-118	4-氯苯烯丙基	Cl	Cl	H	H

I-119	4-氯苯烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-120	4-溴苯烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-121	4-三氯甲基苯烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-122	4-三氯甲氧基苯烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-123	4-五氟乙氧基苯烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-124	4-甲氧基苯烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-125	4-乙氧基苯烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-126	4-氟基苯烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-127	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-128	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	Cl	Cl	H	H
I-129	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-130	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-131	3,5-二氟基-苯烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-132	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	Cl	H	H
I-133	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-134	3-萘-2-基-烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-135	3-(5-三氯甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-136	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-137	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-138	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	Cl	H	H
I-139	4-氯苯甲基	F	F	H	H
I-140	苯烯丙基	F	F	H	H
I-141	4-氯苯烯丙基	F	F	H	H
I-142	4-氟苯烯丙基	F	F	H	H

I-143	4-溴苯烯丙基	F	F	H	H
I-144	4-三氟甲基苯烯丙基	F	F	H	H
I-145	4-三氟甲氧基苯烯丙基	F	F	H	H
I-146	4-五氟乙氧基苯烯丙基	F	F	H	H
I-147	4-甲氧基苯烯丙基	F	F	H	H
I-148	4-乙氧基苯烯丙基	F	F	H	H
I-149	4-氟基苯烯丙基	F	F	H	H
I-150	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	F	F	H	H
I-151	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	F	F	H	H
I-152	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	F	F	H	H
I-153	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	F	F	H	H
I-154	3,5-二氟基-苯烯丙基	F	F	H	H
I-155	5-苯基-戊-2,4-二烯基	F	F	H	H
I-156	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	F	F	H	H
I-157	3-萘-2-基-烯丙基	F	F	H	H
I-158	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	F	H	H
I-159	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	F	H	H
I-160	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	F	H	H
I-161	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	F	F	H	H
I-162	4-氟苯甲基	F	H	F	H
I-163	苯烯丙基	F	H	F	H
I-164	4-氟苯烯丙基	F	H	F	H
I-165	4-氟苯烯丙基	F	H	F	H
I-166	4-溴苯烯丙基	F	H	F	H

I-167	4-三氟甲基苯烯丙基	F	H	F	H
I-168	4-三氟甲氧基苯烯丙基	F	H	F	H
I-169	4-五氟乙氧基苯烯丙基	F	H	F	H
I-170	4-甲氧基苯烯丙基	F	H	F	H
I-171	4-乙氧基苯烯丙基	F	H	F	H
I-172	4-氟基苯烯丙基	F	H	F	H
I-173	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	F	H	F	H
I-174	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	F	H	F	H
I-175	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	F	H	F	H
I-176	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	F	H	F	H
I-177	3,5-二氟基-苯烯丙基	F	H	F	H
I-178	5-苯基-戊-2,4-二烯基	F	H	F	H
I-179	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	F	H	F	H
I-180	3-蔡-2-基-烯丙基	F	H	F	H
I-181	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	F	H
I-182	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	F	H
I-183	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	H	F	H
I-184	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	F	H	F	H
I-185	4-氟苯甲基	F	H	H	F
I-186	苯烯丙基	F	H	H	F
I-187	4-氟苯烯丙基	F	H	H	F
I-188	4-氟苯烯丙基	F	H	H	F
I-189	4-溴苯烯丙基	F	H	H	F
I-190	4-三氟甲基苯烯丙基	F	H	H	F

I-191	4-三氟甲氧基苯烯丙基	F	H	H	F
I-192	4-五氟乙氧基苯烯丙基	F	H	H	F
I-193	4-甲氧基苯烯丙基	F	H	H	F
I-194	4-乙氧基苯烯丙基	F	H	H	F
I-195	4-氟基苯烯丙基	F	H	H	F
I-196	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	F	H	H	F
I-197	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	F	H	H	F
I-198	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	F	H	H	F
I-199	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	F	H	H	F
I-200	3,5-二氟基-苯烯丙基	F	H	H	F
I-201	5-苯基-戊-2,4-二烯基	F	H	H	F
I-202	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	F	H	H	F
I-203	3-萘-2-基-烯丙基	F	H	H	F
I-204	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	H	F
I-205	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	H	F
I-206	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	H	H	F
I-207	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	F	H	H	F
I-208	4-氟苯甲基	Cl	H	Cl	H
I-209	苯烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-210	4-氟苯烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-211	4-氟苯烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-212	4-溴苯烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-213	4-三氟甲基苯烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-214	4-三氟甲氧基苯烯丙基	Cl	H	Cl	H

I-215	4-五氟乙氧基苯烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-216	4-甲氧基苯烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-217	4-乙氧基苯烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-218	4-氟基苯烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-219	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-220	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	Cl	H	Cl	H
I-221	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-222	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-223	3,5-二氟基-苯烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-224	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	H	Cl	H
I-225	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-226	3-萘-2-基-烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-227	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-228	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-229	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-230	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	H
I-231	4-氟苯甲基	Cl	H	H	Cl
I-232	苯烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-233	4-氟苯烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-234	4-氟苯烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-235	4-溴苯烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-236	4-三氟甲基苯烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-237	4-三氟甲氧基苯烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-238	4-五氟乙氧基苯烯丙基	Cl	H	H	Cl

I-239	4-甲氧基苯烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-240	4-乙氧基苯烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-241	4-氯基苯烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-242	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-243	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	Cl	H	H	Cl
I-244	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-245	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-246	3,5-二氯基-苯烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-247	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	H	H	Cl
I-248	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-249	3-萘-2-基-烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-250	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-251	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-252	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-253	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	H	H	Cl
I-254	4-氯苯甲基	F	Cl	H	H
I-255	苯烯丙基	F	Cl	H	H
I-256	4-氯苯烯丙基	F	Cl	H	H
I-257	4-氯苯烯丙基	F	Cl	H	H
I-258	4-溴苯烯丙基	F	Cl	H	H
I-259	4-三氟甲基苯烯丙基	F	Cl	H	H
I-260	4-三氟甲氧基苯烯丙基	F	Cl	H	H
I-261	4-五氟乙氧基苯烯丙基	F	Cl	H	H
I-262	4-甲氧基苯烯丙基	F	Cl	H	H

I-263	4-乙氧基苯烯丙基	F	Cl	H	H
I-264	4-氯基苯烯丙基	F	Cl	H	H
I-265	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	F	Cl	H	H
I-266	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	F	Cl	H	H
I-267	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	F	Cl	H	H
I-268	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	F	Cl	H	H
I-269	3,5-二氯基-苯烯丙基	F	Cl	H	H
I-270	5-苯基-戊-2,4-二烯基	F	Cl	H	H
I-271	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	F	Cl	H	H
I-272	3-萘-2-基-烯丙基	F	Cl	H	H
I-273	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	Cl	H	H
I-274	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	Cl	H	H
I-275	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	Cl	H	H
I-276	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	F	Cl	H	H
I-277	4-氯苯甲基	F	H	Cl	H
I-278	苯烯丙基	F	H	Cl	H
I-279	4-氯苯烯丙基	F	H	Cl	H
I-280	4-氯苯烯丙基	F	H	Cl	H
I-281	4-溴苯烯丙基	F	H	Cl	H
I-282	4-三氟甲基苯烯丙基	F	H	Cl	H
I-283	4-三氟甲氧基苯烯丙基	F	H	Cl	H
I-284	4-五氟乙氧基苯烯丙基	F	H	Cl	H
I-285	4-甲氧基苯烯丙基	F	H	Cl	H
I-286	4-乙氧基苯烯丙基	F	H	Cl	H

I-287	4-氯基苯烯丙基	F	H	Cl	H
I-288	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	F	H	Cl	H
I-289	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	F	H	Cl	H
I-290	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	F	H	Cl	H
I-291	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	F	H	Cl	H
I-292	3,5-二氯基-苯烯丙基	F	H	Cl	H
I-293	5-苯基-戊-2,4-二烯基	F	H	Cl	H
I-294	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	F	H	Cl	H
I-295	3-萘-2-基-烯丙基	F	H	Cl	H
I-296	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	Cl	H
I-297	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	Cl	H
I-298	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	H	Cl	H
I-299	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	F	H	Cl	H
I-300	4-氯苯甲基	F	H	H	Cl
I-301	苯烯丙基	F	H	H	Cl
I-302	4-氯苯烯丙基	F	H	H	Cl
I-303	4-氯苯烯丙基	F	H	H	Cl
I-304	4-溴苯烯丙基	F	H	H	Cl
I-305	4-三氟甲基苯烯丙基	F	H	H	Cl
I-306	4-三氟甲氧基苯烯丙基	F	H	H	Cl
I-307	4-五氟乙氧基苯烯丙基	F	H	H	Cl
I-308	4-甲氧基苯烯丙基	F	H	H	Cl
I-309	4-乙氧基苯烯丙基	F	H	H	Cl
I-310	4-氯基苯烯丙基	F	H	H	Cl

I-311	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	F	H	H	Cl
I-312	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	F	H	H	Cl
I-313	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	F	H	H	Cl
I-314	3-氯基-4-氟基-苯烯丙基	F	H	H	Cl
I-315	3,5-二氯基-苯烯丙基	F	H	H	Cl
I-316	5-苯基-戊-2,4-二烯基	F	H	H	Cl
I-317	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	F	H	H	Cl
I-318	3-萘-2-基-烯丙基	F	H	H	Cl
I-319	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	H	Cl
I-320	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	H	Cl
I-321	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	H	H	Cl
I-322	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	F	H	H	Cl
I-323	4-氯苯甲基	Cl	F	H	H
I-324	苯烯丙基	Cl	F	H	H
I-325	4-氯苯烯丙基	Cl	F	H	H
I-326	4-氟苯烯丙基	Cl	F	H	H
I-327	4-溴苯烯丙基	Cl	F	H	H
I-328	4-三氟甲基苯烯丙基	Cl	F	H	H
I-329	4-三氟甲氧基苯烯丙基	Cl	F	H	H
I-330	4-五氟乙氧基苯烯丙基	Cl	F	H	H
I-331	4-甲氧基苯烯丙基	Cl	F	H	H
I-332	4-乙氧基苯烯丙基	Cl	F	H	H
I-333	4-氟基苯烯丙基	Cl	F	H	H
I-334	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	F	H	H

I-335	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	Cl	F	H	H
I-336	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	Cl	F	H	H
I-337	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	Cl	F	H	H
I-338	3,5-二氟基-苯烯丙基	Cl	F	H	H
I-339	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	F	H	H
I-340	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	Cl	F	H	H
I-341	3-萘-2-基-烯丙基	Cl	F	H	H
I-342	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	F	H	H
I-343	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	F	H	H
I-344	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	F	H	H
I-345	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	F	H	H
I-346	4-氯苯甲基	H	F	Cl	H
I-347	苯烯丙基	H	F	Cl	H
I-348	4-氯苯烯丙基	H	F	Cl	H
I-349	4-氟苯烯丙基	H	F	Cl	H
I-350	4-溴苯烯丙基	H	F	Cl	H
I-351	4-三氟甲基苯烯丙基	H	F	Cl	H
I-352	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	F	Cl	H
I-353	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	F	Cl	H
I-354	4-甲氧基苯烯丙基	H	F	Cl	H
I-355	4-乙氧基苯烯丙基	H	F	Cl	H
I-356	4-氟基苯烯丙基	H	F	Cl	H
I-357	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	F	Cl	H
I-358	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	F	Cl	H

I-359	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	H	F	Cl	H
I-360	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	H	F	Cl	H
I-361	3,5-二氟基-苯烯丙基	H	F	Cl	H
I-362	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	F	Cl	H
I-363	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	F	Cl	H
I-364	3-萘-2-基-烯丙基	H	F	Cl	H
I-365	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	F	Cl	H
I-366	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	F	Cl	H
I-367	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	F	Cl	H
I-368	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	F	Cl	H
I-369	4-氯苯甲基	H	F	H	Cl
I-370	苯烯丙基	H	F	H	Cl
I-371	4-氯苯烯丙基	H	F	H	Cl
I-372	4-氟苯烯丙基	H	F	H	Cl
I-373	4-溴苯烯丙基	H	F	H	Cl
I-374	4-三氟甲基苯烯丙基	H	F	H	Cl
I-375	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	F	H	Cl
I-376	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	F	H	Cl
I-377	4-甲氧基苯烯丙基	H	F	H	Cl
I-378	4-乙氧基苯烯丙基	H	F	H	Cl
I-379	4-氟基苯烯丙基	H	F	H	Cl
I-380	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	F	H	Cl
I-381	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	F	H	Cl
I-382	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	H	F	H	Cl

I-383	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	H	F	H	Cl
I-384	3,5-二氯基-苯烯丙基	H	F	H	Cl
I-385	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	F	H	Cl
I-386	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	F	H	Cl
I-387	3-萘-2-基-烯丙基	H	F	H	Cl
I-388	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	F	H	Cl
I-389	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	F	H	Cl
I-390	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	F	H	Cl
I-391	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	F	H	Cl
I-392	4-氯苯甲基	Cl	H	F	H
I-393	苯烯丙基	Cl	H	F	H
I-394	4-氯苯烯丙基	Cl	H	F	H
I-395	4-氯苯烯丙基	Cl	H	F	H
I-396	4-溴苯烯丙基	Cl	H	F	H
I-397	4-三氟甲基苯烯丙基	Cl	H	F	H
I-398	4-三氟甲氧基苯烯丙基	Cl	H	F	H
I-399	4-五氟乙氧基苯烯丙基	Cl	H	F	H
I-400	4-甲氧基苯烯丙基	Cl	H	F	H
I-401	4-乙氧基苯烯丙基	Cl	H	F	H
I-402	4-氯基苯烯丙基	Cl	H	F	H
I-403	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	H	F	H
I-404	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	Cl	H	F	H
I-405	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	Cl	H	F	H
I-406	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	Cl	H	F	H

I-407	3,5-二氯基-苯烯丙基	Cl	H	F	H
I-408	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	H	F	H
I-409	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	Cl	H	F	H
I-410	3-蔡-2-基-烯丙基	Cl	H	F	H
I-411	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	F	H
I-412	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	F	H
I-413	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	H	F	H
I-414	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	H	F	H
I-415	4-氯苯甲基	H	Cl	F	H
I-416	苯烯丙基	H	Cl	F	H
I-417	4-氯苯烯丙基	H	Cl	F	H
I-418	4-氯苯烯丙基	H	Cl	F	H
I-419	4-溴苯烯丙基	H	Cl	F	H
I-420	4-三氟甲基苯烯丙基	H	Cl	F	H
I-421	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	Cl	F	H
I-422	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	Cl	F	H
I-423	4-甲氧基苯烯丙基	H	Cl	F	H
I-424	4-乙氧基苯烯丙基	H	Cl	F	H
I-425	4-氯基苯烯丙基	H	Cl	F	H
I-426	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	Cl	F	H
I-427	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	Cl	F	H
I-428	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	H	Cl	F	H
I-429	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	H	Cl	F	H
I-430	3,5-二氯基-苯烯丙基	H	Cl	F	H

I-431	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	Cl	F	H
I-432	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	Cl	F	H
I-433	3-萘-2-基-烯丙基	H	Cl	F	H
I-434	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	F	H
I-435	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	F	H
I-436	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	Cl	F	H
I-437	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	Cl	F	H
I-438	4-氯苯甲基	H	H	F	Cl
I-439	苯烯丙基	H	H	F	Cl
I-440	4-氯苯烯丙基	H	H	F	Cl
I-441	4-氯苯烯丙基	H	H	F	Cl
I-442	4-溴苯烯丙基	H	H	F	Cl
I-443	4-三氟甲基苯烯丙基	H	H	F	Cl
I-444	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	H	F	Cl
I-445	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	H	F	Cl
I-446	4-甲氧基苯烯丙基	H	H	F	Cl
I-447	4-乙氧基苯烯丙基	H	H	F	Cl
I-448	4-氯基苯烯丙基	H	H	F	Cl
I-449	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	H	F	Cl
I-450	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	H	F	Cl
I-451	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	H	H	F	Cl
I-452	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	H	H	F	Cl
I-453	3,5-二氯基-苯烯丙基	H	H	F	Cl
I-454	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	H	F	Cl



I-455	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	H	F	Cl
I-456	3-萘-2-基-烯丙基	H	H	F	Cl
I-457	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	F	Cl
I-458	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	F	Cl
I-459	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	H	F	Cl
I-460	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	H	F	Cl
I-461	4-氯苯甲基	Cl	H	H	F
I-462	苯烯丙基	Cl	H	H	F
I-463	4-氯苯烯丙基	Cl	H	H	F
I-464	4-氯苯烯丙基	Cl	H	H	F
I-465	4-溴苯烯丙基	Cl	H	H	F
I-466	4-三氟甲基苯烯丙基	Cl	H	H	F
I-467	4-三氟甲氧基苯烯丙基	Cl	H	H	F
I-468	4-五氟乙氧基苯烯丙基	Cl	H	H	F
I-469	4-甲氧基苯烯丙基	Cl	H	H	F
I-470	4-乙氧基苯烯丙基	Cl	H	H	F
I-471	4-氯基苯烯丙基	Cl	H	H	F
I-472	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	H	H	F
I-473	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	Cl	H	H	F
I-474	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	Cl	H	H	F
I-475	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	Cl	H	H	F
I-476	3,5-二氯基-苯烯丙基	Cl	H	H	F
I-477	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	H	H	F
I-478	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	Cl	H	H	F

I-479	3-萘-2-基-烯丙基	Cl	H	H	F
I-480	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	H	F
I-481	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	H	F
I-482	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	H	H	F
I-483	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	H	H	F
I-484	4-氯苯甲基	H	Cl	H	F
I-485	苯烯丙基	H	Cl	H	F
I-486	4-氯苯烯丙基	H	Cl	H	F
I-487	4-氯苯烯丙基	H	Cl	H	F
I-488	4-溴苯烯丙基	H	Cl	H	F
I-489	4-三氟甲基苯烯丙基	H	Cl	H	F
I-490	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	Cl	H	F
I-491	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	Cl	H	F
I-492	4-甲氧基苯烯丙基	H	Cl	H	F
I-493	4-乙氧基苯烯丙基	H	Cl	H	F
I-494	4-氯基苯烯丙基	H	Cl	H	F
I-495	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	Cl	H	F
I-496	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	Cl	H	F
I-497	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	H	Cl	H	F
I-498	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	H	Cl	H	F
I-499	3,5-二氯基-苯烯丙基	H	Cl	H	F
I-500	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	Cl	H	F
I-501	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	Cl	H	F
I-502	3-萘-2-基-烯丙基	H	Cl	H	F

I-503	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	H	F
I-504	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	H	F
I-505	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	Cl	H	F
I-506	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	Cl	H	F
I-507	4-氟苯甲基	H	H	Cl	F
I-508	苯烯丙基	H	H	Cl	F
I-509	4-氟苯烯丙基	H	H	Cl	F
I-510	4-氟苯烯丙基	H	H	Cl	F
I-511	4-溴苯烯丙基	H	H	Cl	F
I-512	4-三氟甲基苯烯丙基	H	H	Cl	F
I-513	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	H	Cl	F
I-514	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	H	Cl	F
I-515	4-甲氧基苯烯丙基	H	H	Cl	F
I-516	4-乙氧基苯烯丙基	H	H	Cl	F
I-517	4-氟基苯烯丙基	H	H	Cl	F
I-518	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	H	Cl	F
I-519	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	H	H	Cl	F
I-520	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	H	H	Cl	F
I-521	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	H	H	Cl	F
I-522	3,5-二氟基-苯烯丙基	H	H	Cl	F
I-523	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	H	Cl	F
I-524	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	H	Cl	F
I-525	3-蔡-2-基-烯丙基	H	H	Cl	F
I-526	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	Cl	F



I-527	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	Cl	F
I-528	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	H	Cl	F
I-529	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	H	Cl	F
I-530	4-氯苯甲基	H	F	F	F
I-531	苯烯丙基	H	F	F	F
I-532	4-氯苯烯丙基	H	F	F	F
I-533	4-氯苯烯丙基	H	F	F	F
I-534	4-溴苯烯丙基	H	F	F	F
I-535	4-三氟甲基苯烯丙基	H	F	F	F
I-536	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	F	F	F
I-537	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	F	F	F
I-538	4-甲氧基苯烯丙基	H	F	F	F
I-539	4-乙氧基苯烯丙基	H	F	F	F
I-540	4-氯基苯烯丙基	H	F	F	F
I-541	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	F	F	F
I-542	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	F	F	F
I-543	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	H	F	F	F
I-544	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	H	F	F	F
I-545	3,5-二氯基-苯烯丙基	H	F	F	F
I-546	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	F	F	F
I-547	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	F	F	F
I-548	3-蔡-2-基-烯丙基	H	F	F	F
I-549	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	F	F	F
I-550	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	F	F	F

I-551	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	F	F	F
I-552	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	F	F	F
I-553	4-氯苯甲基	F	H	F	F
I-554	苯烯丙基	F	H	F	F
I-555	4-氯苯烯丙基	F	H	F	F
I-556	4-氯苯烯丙基	F	H	F	F
I-557	4-溴苯烯丙基	F	H	F	F
I-558	4-三氟甲基苯烯丙基	F	H	F	F
I-559	4-三氟甲氧基苯烯丙基	F	H	F	F
I-560	4-五氟乙氧基苯烯丙基	F	H	F	F
I-561	4-甲氧基苯烯丙基	F	H	F	F
I-562	4-乙氧基苯烯丙基	F	H	F	F
I-563	4-氰基苯烯丙基	F	H	F	F
I-564	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	F	H	F	F
I-565	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	F	H	F	F
I-566	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	F	H	F	F
I-567	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	F	H	F	F
I-568	3,5-二氯基-苯烯丙基	F	H	F	F
I-569	5-苯基-戊-2,4-二烯基	F	H	F	F
I-570	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	F	H	F	F
I-571	3-蔡-2-基-烯丙基	F	H	F	F
I-572	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	F	F
I-573	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	H	F	F
I-574	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	H	F	F

I-575	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	F	H	F	F
I-576	4-氯苯甲基	F	F	H	F
I-577	苯烯丙基	F	F	H	F
I-578	4-氯苯烯丙基	F	F	H	F
I-579	4-氯苯烯丙基	F	F	H	F
I-580	4-溴苯烯丙基	F	F	H	F
I-581	4-三氟甲基苯烯丙基	F	F	H	F
I-582	4-三氟甲氧基苯烯丙基	F	F	H	F
I-583	4-五氟乙氧基苯烯丙基	F	F	H	F
I-584	4-甲氧基苯烯丙基	F	F	H	F
I-585	4-乙氧基苯烯丙基	F	F	H	F
I-586	4-氯基苯烯丙基	F	F	H	F
I-587	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	F	F	H	F
I-588	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	F	F	H	F
I-589	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	F	F	H	F
I-590	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	F	F	H	F
I-591	3,5-二氯基-苯烯丙基	F	F	H	F
I-592	5-苯基-戊-2,4-二烯基	F	F	H	F
I-593	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	F	F	H	F
I-594	3-萘-2-基-烯丙基	F	F	H	F
I-595	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	F	H	F
I-596	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	F	H	F
I-597	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	F	H	F
I-598	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	F	F	H	F

I-599	4-氯苯甲基	F	F	F	H
I-600	苯烯丙基	F	F	F	H
I-601	4-氯苯烯丙基	F	F	F	H
I-602	4-氟苯烯丙基	F	F	F	H
I-603	4-溴苯烯丙基	F	F	F	H
I-604	4-三氟甲基苯烯丙基	F	F	F	H
I-605	4-三氟甲氧基苯烯丙基	F	F	F	H
I-606	4-五氟乙氧基苯烯丙基	F	F	F	H
I-607	4-甲氧基苯烯丙基	F	F	F	H
I-608	4-乙氧基苯烯丙基	F	F	F	H
I-609	4-氨基苯烯丙基	F	F	F	H
I-610	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	F	F	F	H
I-611	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	F	F	F	H
I-612	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	F	F	F	H
I-613	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	F	F	F	H
I-614	3,5-二氟基-苯烯丙基	F	F	F	H
I-615	5-苯基-戊-2,4-二烯基	F	F	F	H
I-616	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	F	F	F	H
I-617	3-蔡-2-基-烯丙基	F	F	F	H
I-618	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	F	F	H
I-619	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	F	F	H
I-620	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	F	F	H
I-621	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	F	F	F	H
I-622	4-氯苯甲基	H	Cl	Cl	Cl

I-623	苯烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-624	4-氯苯烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-625	4-氯苯烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-626	4-溴苯烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-627	4-三氟甲基苯烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-628	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-629	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-630	4-甲氧基苯烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-631	4-乙氧基苯烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-632	4-氟基苯烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-633	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-634	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	Cl	Cl	Cl
I-635	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-636	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-637	3,5-二氟基-苯烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-638	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	Cl	Cl	Cl
I-639	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-640	3-萘-2-基-烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-641	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-642	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-643	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-644	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	Cl
I-645	4-氯苯甲基	Cl	H	Cl	Cl
I-646	苯烯丙基	Cl	H	Cl	Cl

I-647	4-氯苯烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-648	4-氯苯烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-649	4-溴苯烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-650	4-三氟甲基苯烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-651	4-三氟甲氧基苯烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-652	4-五氟乙氧基苯烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-653	4-甲氧基苯烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-654	4-乙氧基苯烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-655	4-氟基苯烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-656	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-657	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	Cl	H	Cl	Cl
I-658	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-659	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-660	3,5-二氟基-苯烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-661	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	H	Cl	Cl
I-662	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-663	3-萘-2-基-烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-664	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-665	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-666	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-667	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	H	Cl	Cl
I-668	4-氯苯甲基	Cl	Cl	H	Cl
I-669	苯烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-670	4-氯苯烯丙基	Cl	Cl	H	Cl

I-671	4-氯苯烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-672	4-溴苯烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-673	4-三氟甲基苯烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-674	4-三氟甲氧基苯烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-675	4-五氟乙氧基苯烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-676	4-甲氧基苯烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-677	4-乙氧基苯烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-678	4-氟基苯烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-679	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-680	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	Cl	Cl	H	Cl
I-681	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-682	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-683	3,5-二氟基-苯烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-684	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	Cl	H	Cl
I-685	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-686	3-萘-2-基-烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-687	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-688	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-689	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-690	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	Cl	H	Cl
I-691	4-氯苯甲基	Cl	Cl	Cl	H
I-692	苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-693	4-氯苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-694	4-氯苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	H

I-695	4-溴苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-696	4-三氟甲基苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-697	4-三氟甲氧基苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-698	4-五氟乙氧基苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-699	4-甲氧基苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-700	4-乙氧基苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-701	4-氟基苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-702	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-703	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	Cl	Cl	Cl	H
I-704	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-705	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-706	3,5-二氟基-苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-707	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	Cl	Cl	H
I-708	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-709	3-萘-2-基-烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-710	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-711	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-712	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-713	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	H
I-714	4-氟苯甲基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-715	苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-716	4-氟苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-717	4-氟苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-718	4-溴苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl

I-719	4-三氟甲基苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-720	4-三氟甲氧基苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-721	4-五氟乙氧基苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-722	4-甲氧基苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-723	4-乙氧基苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-724	4-氟基苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-725	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-726	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-727	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-728	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-729	3,5-二氟基-苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-730	5-苯基-戊-2,4-二烯基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-731	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-732	3-萘-2-基-烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-733	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-734	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-735	3-吡啶-4-基-烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-736	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	Cl	Cl	Cl	Cl
I-737	4-氟苯甲基	F	F	F	F
I-738	苯烯丙基	F	F	F	F
I-739	4-氟苯烯丙基	F	F	F	F
I-740	4-氟苯烯丙基	F	F	F	F
I-741	4-溴苯烯丙基	F	F	F	F
I-742	4-三氟甲基苯烯丙基	F	F	F	F

I-743	4-三氟甲氧基苯烯丙基	F	F	F	F
I-744	4-五氟乙氧基苯烯丙基	F	F	F	F
I-745	4-甲氧基苯烯丙基	F	F	F	F
I-746	4-乙氧基苯烯丙基	F	F	F	F
I-747	4-氟基苯烯丙基	F	F	F	F
I-748	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	F	F	F	F
I-749	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	F	F	F	F
I-750	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	F	F	F	F
I-751	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	F	F	F	F
I-752	3,5-二氟基-苯烯丙基	F	F	F	F
I-753	5-苯基-戊-2,4-二烯基	F	F	F	F
I-754	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	F	F	F	F
I-755	3-萘-2-基-烯丙基	F	F	F	F
I-756	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	F	F	F
I-757	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	F	F	F	F
I-758	3-吡啶-4-基-烯丙基	F	F	F	F
I-759	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	F	F	F	F
I-760	4-氟苯甲基	H	F	H	F
I-761	苯烯丙基	H	F	H	F
I-762	4-氟苯烯丙基	H	F	H	F
I-763	4-氟苯烯丙基	H	F	H	F
I-764	4-溴苯烯丙基	H	F	H	F
I-765	4-三氟甲基苯烯丙基	H	F	H	F
I-766	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	F	H	F

I-767	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	F	H	F
I-768	4-甲氧基苯烯丙基	H	F	H	F
I-769	4-乙氧基苯烯丙基	H	F	H	F
I-770	4-氟基苯烯丙基	H	F	H	F
I-771	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	F	H	F
I-772	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	H	F	H	F
I-773	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	H	F	H	F
I-774	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	H	F	H	F
I-775	3,5-二氟基-苯烯丙基	H	F	H	F
I-776	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	F	H	F
I-777	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	F	H	F
I-778	3-萘-2-基-烯丙基	H	F	H	F
I-779	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	F	H	F
I-780	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	F	H	F
I-781	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	F	H	F
I-782	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	F	H	F
I-783	4-氟苯甲基	H	F	F	H
I-784	苯烯丙基	H	F	F	H
I-785	4-氟苯烯丙基	H	F	F	H
I-786	4-氟苯烯丙基	H	F	F	H
I-787	4-溴苯烯丙基	H	F	F	H
I-788	4-三氟甲基苯烯丙基	H	F	F	H
I-789	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	F	F	H
I-790	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	F	F	H

I-791	4-甲氧基苯烯丙基	H	F	F	H
I-792	4-乙氧基苯烯丙基	H	F	F	H
I-793	4-氟基苯烯丙基	H	F	F	H
I-794	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	F	F	H
I-795	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	H	F	F	H
I-796	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	H	F	F	H
I-797	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	H	F	F	H
I-798	3,5-二氟基-苯烯丙基	H	F	F	H
I-799	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	F	F	H
I-800	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	F	F	H
I-801	3-萘-2-基-烯丙基	H	F	F	H
I-802	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	F	F	H
I-803	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	F	F	H
I-804	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	F	F	H
I-805	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	F	F	H
I-806	4-氟苯甲基	H	F	F	H
I-807	苯烯丙基	H	H	F	F
I-808	4-氟苯烯丙基	H	H	F	F
I-809	4-氟苯烯丙基	H	H	F	F
I-810	4-溴苯烯丙基	H	H	F	F
I-811	4-三氟甲基苯烯丙基	H	H	F	F
I-812	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	H	F	F
I-813	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	H	F	F
I-814	4-甲氧基苯烯丙基	H	H	F	F

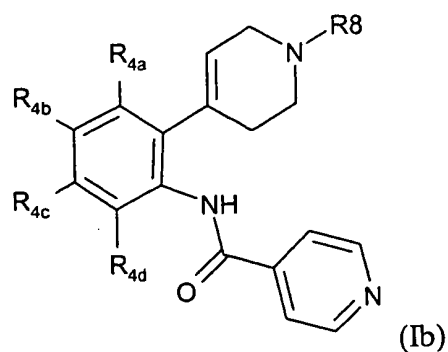
I-815	4-乙氧基苯烯丙基	H	H	F	F
I-816	4-氟基苯烯丙基	H	H	F	F
I-817	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	H	F	F
I-818	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	H	H	F	F
I-819	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	H	H	F	F
I-820	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	H	H	F	F
I-821	3,5-二氟基-苯烯丙基	H	H	F	F
I-822	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	H	F	F
I-823	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	H	F	F
I-824	3-萘-2-基-烯丙基	H	H	F	F
I-825	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	F	F
I-826	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	F	F
I-827	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	H	F	F
I-828	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	H	F	F
I-829	4-氟苯甲基	H	H	Cl	Cl
I-830	苯烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-831	4-氟苯烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-832	4-氟苯烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-833	4-溴苯烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-834	4-三氟甲基苯烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-835	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-836	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-837	4-甲氧基苯烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-838	4-乙氧基苯烯丙基	H	H	Cl	Cl

I-839	4-氯基苯烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-840	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-841	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	H	Cl	Cl
I-842	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-843	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-844	3,5-二氯基-苯烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-845	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	H	Cl	Cl
I-846	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-847	3-萘-2-基-烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-848	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-849	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-850	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-851	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	H	Cl	Cl
I-852	4-氯苯甲基	H	Cl	Cl	H
I-853	苯烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-854	4-氯苯烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-855	4-氯苯烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-856	4-溴苯烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-857	4-三氟甲基苯烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-858	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-859	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-860	4-甲氧基苯烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-861	4-乙氧基苯烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-862	4-氯基苯烯丙基	H	Cl	Cl	H

I-863	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-864	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	Cl	Cl	H
I-865	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-866	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-867	3,5-二氯基-苯烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-868	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	Cl	Cl	H
I-869	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-870	3-萘-2-基-烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-871	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-872	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-873	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-874	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	Cl	Cl	H
I-875	4-氯苯甲基	H	Cl	H	Cl
I-876	苯烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-877	4-氯苯烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-878	4-氯苯烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-879	4-溴苯烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-880	4-三氟甲基苯烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-881	4-三氟甲氧基苯烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-882	4-五氟乙氧基苯烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-883	4-甲氧基苯烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-884	4-乙氧基苯烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-885	4-氯基苯烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-886	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	H	Cl	H	Cl

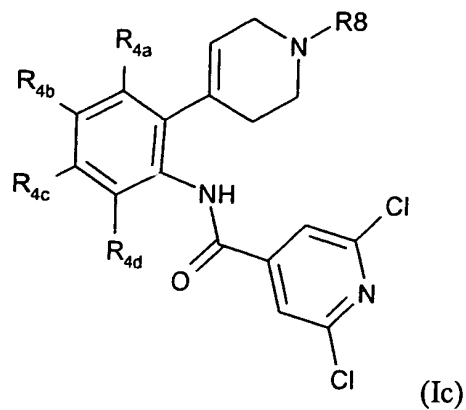
I-887	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	H	Cl	H	Cl
I-888	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-889	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-890	3,5-二氯基-苯烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-891	5-苯基-戊-2,4-二烯基	H	Cl	H	Cl
I-892	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-893	3-萘-2-基-烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-894	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-895	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-896	3-吡啶-4-基-烯丙基	H	Cl	H	Cl
I-897	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	H	Cl	H	Cl

表 II 提供 897 個式 Ib 之化合物



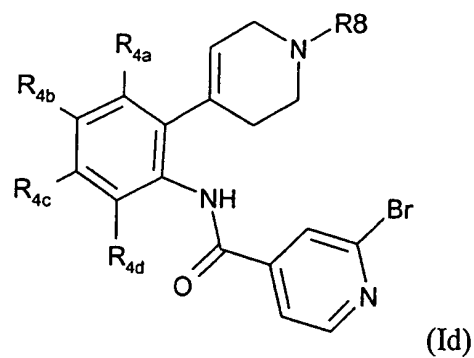
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 III 提供 897 個式 Ic 之化合物



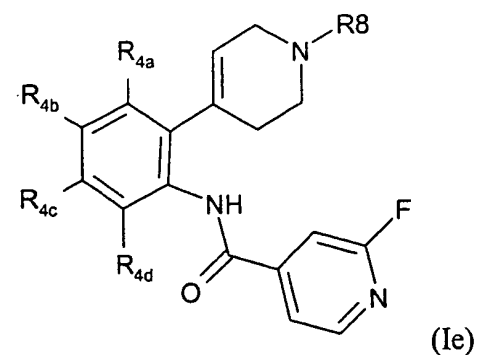
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 IV 提供 897 個式 Id 之化合物



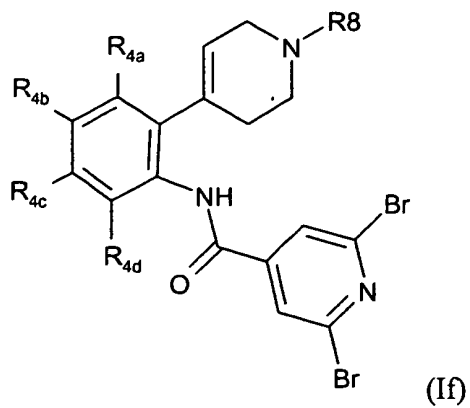
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 V 提供 897 個式 Ie 之化合物



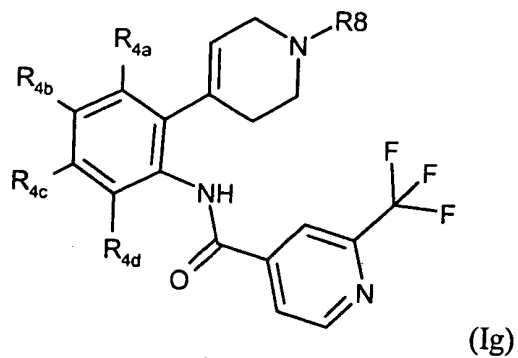
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 VI 提供 897 個式 If 之化合物



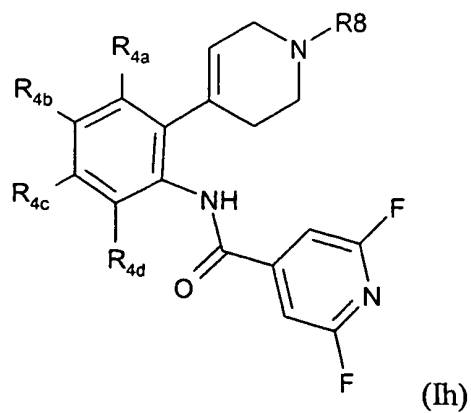
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 VII 提供 897 個式 Ig 之化合物



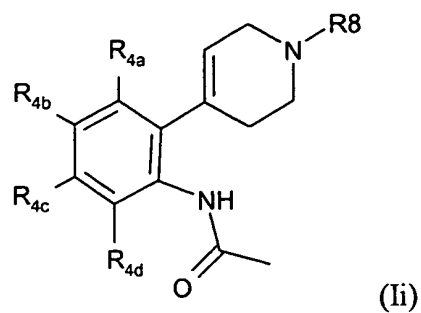
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 VIII 提供 897 個式 Ih 之化合物



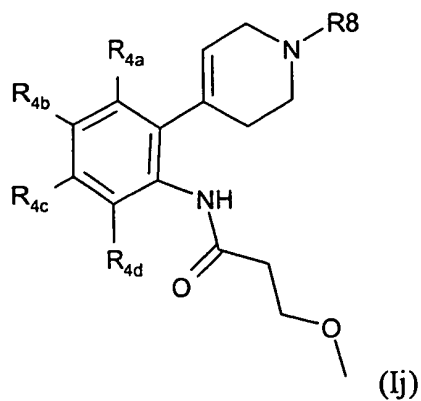
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 IX 提供 897 個式 Ii 之化合物



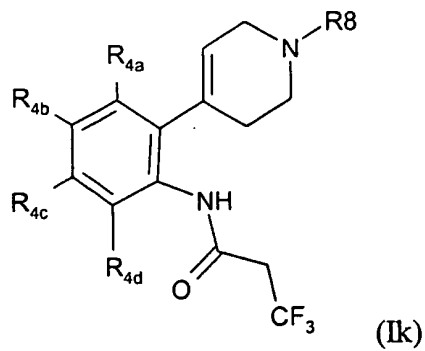
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 X 提供 897 個式 Ij 之化合物



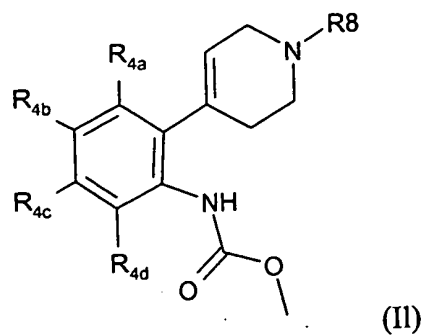
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XI 提供 897 個式 Ik 之化合物



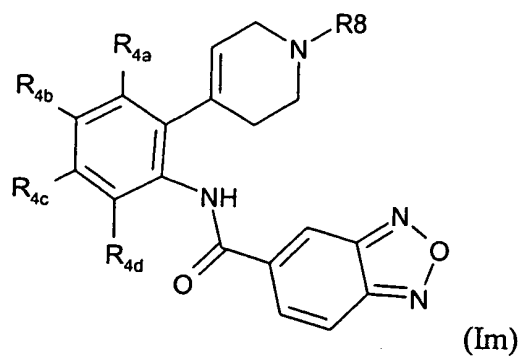
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XII 提供 897 個式 II 之化合物



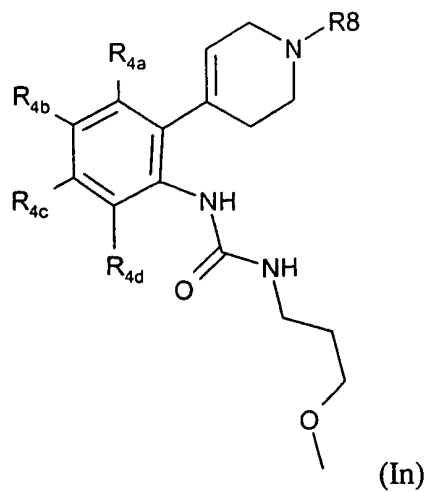
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XIII 提供 897 個式 Im 之化合物



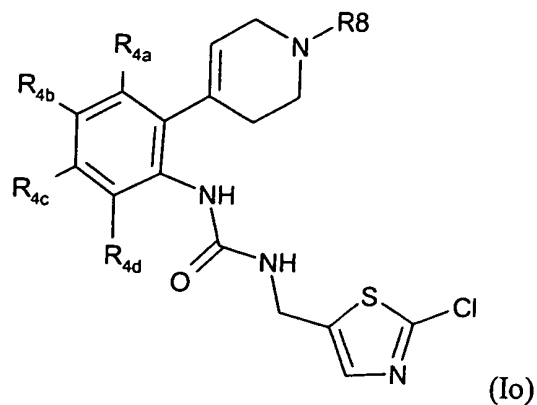
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XIV 提供 897 個式 In 之化合物



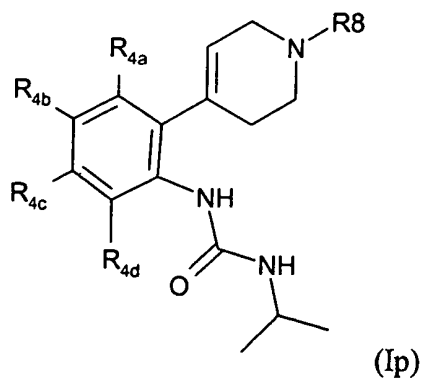
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XV 提供 897 個式 Io 之化合物



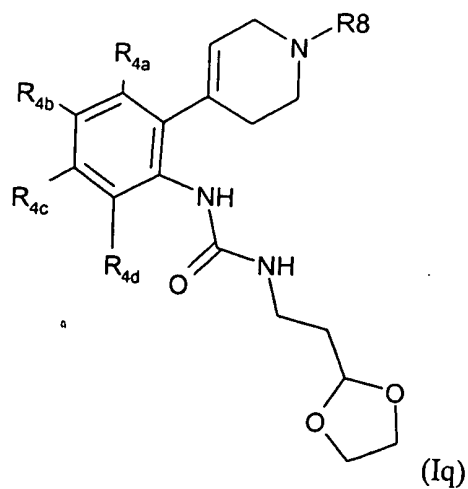
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XVI 提供 897 個式 Ip 之化合物



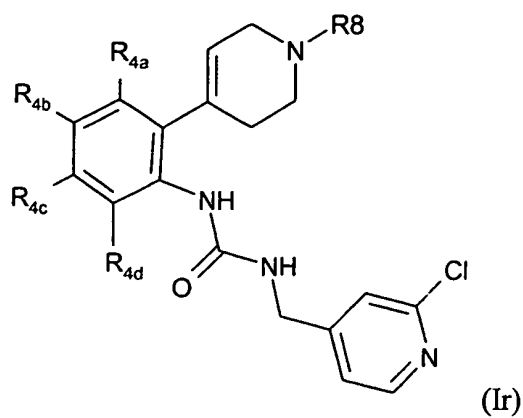
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XVII 提供 897 個式 Iq 之化合物



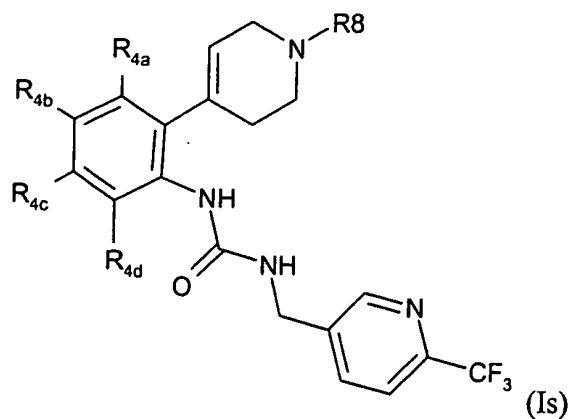
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XVIII 提供 897 個式 Ir 之化合物



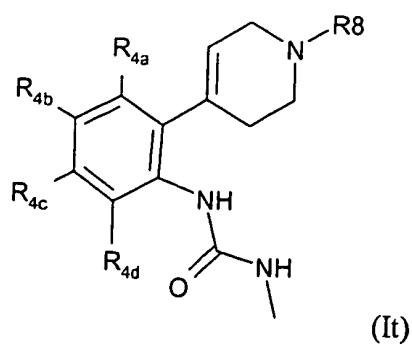
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XIX 提供 897 個式 Is 之化合物



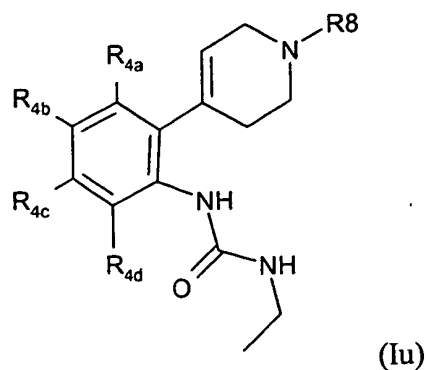
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XX 提供 897 個式 It 之化合物



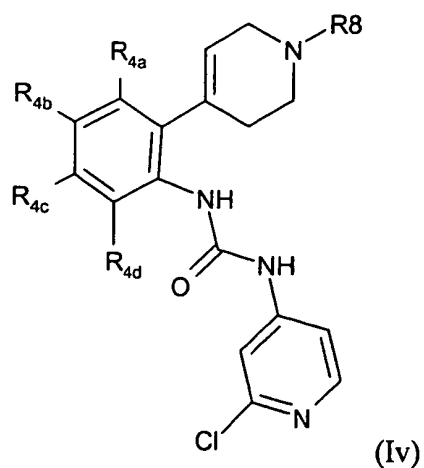
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXI 提供 897 個式 Iu 之化合物



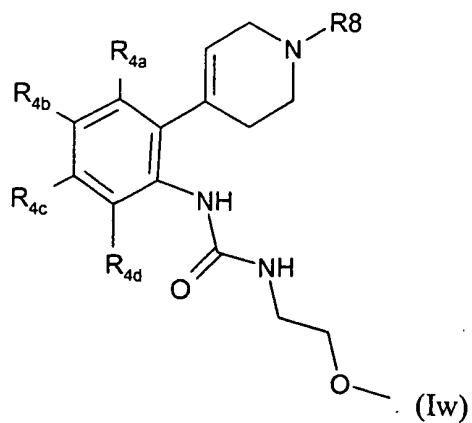
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXII 提供 897 個式 Iv 之化合物



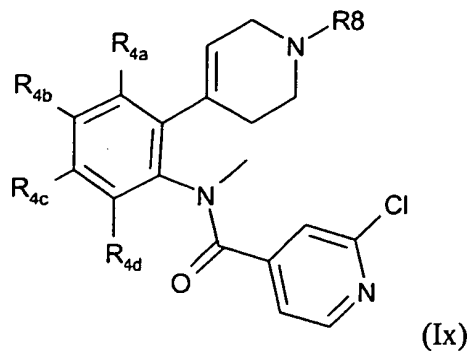
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXIII 提供 897 個式 Iw 之化合物



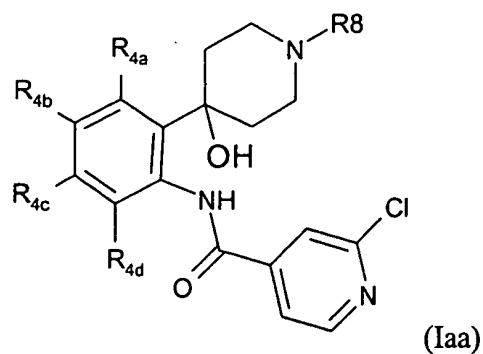
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXIV 提供 897 個式 Ix 之化合物



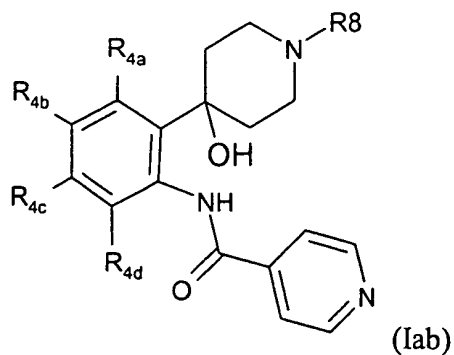
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXV 提供 897 個式 Iaa 之化合物



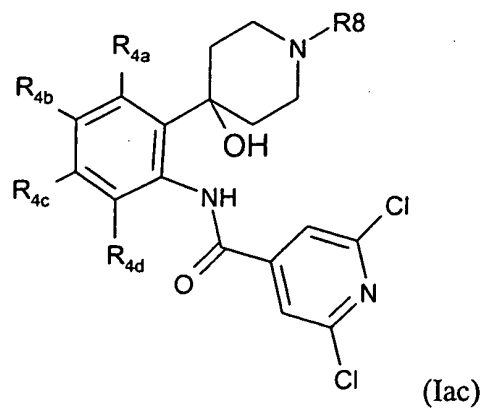
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXVI 提供 897 個式 Iab 之化合物



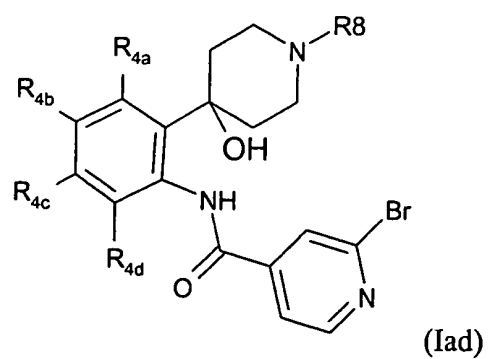
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXVII 提供 897 個式 Iac 之化合物



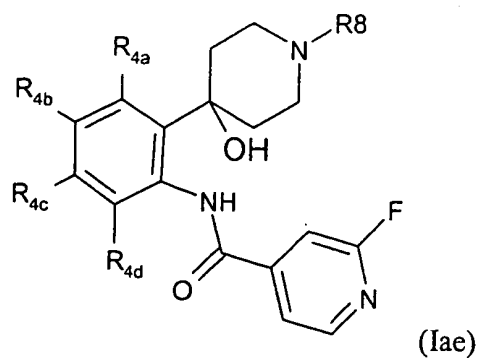
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXVIII 提供 897 個式 Iad 之化合物



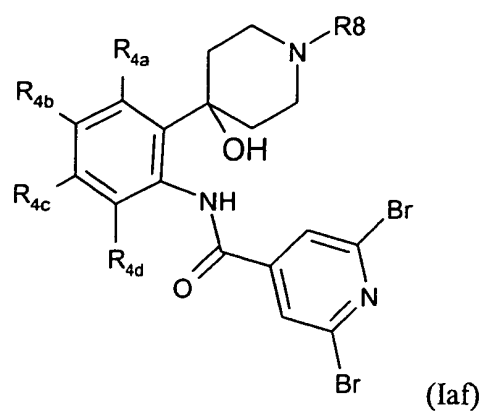
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXIX 提供 897 個式 Iae 之化合物



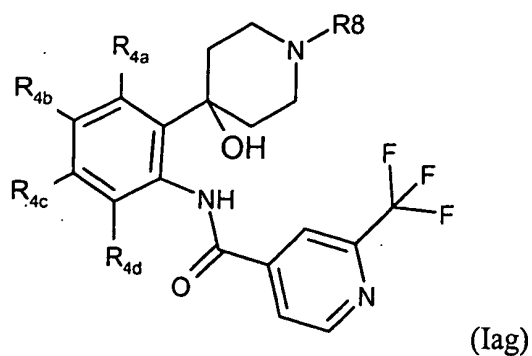
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXX 提供 897 個式 Iaf 之化合物



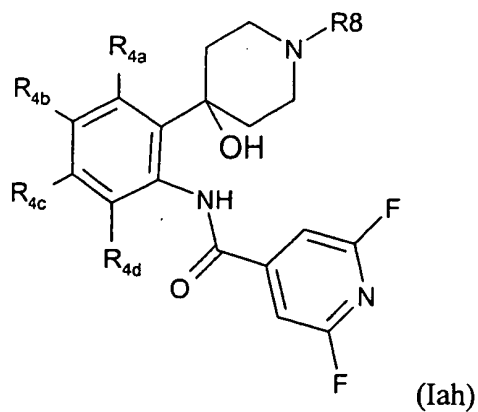
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXXI 提供 897 個式 Iag 之化合物



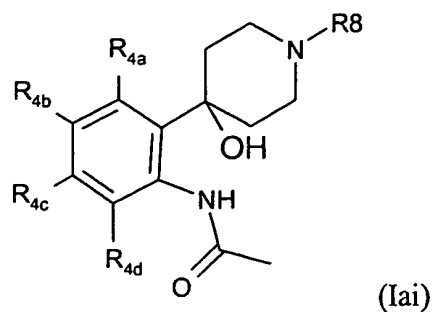
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXXII 提供 897 個式 Iah 之化合物



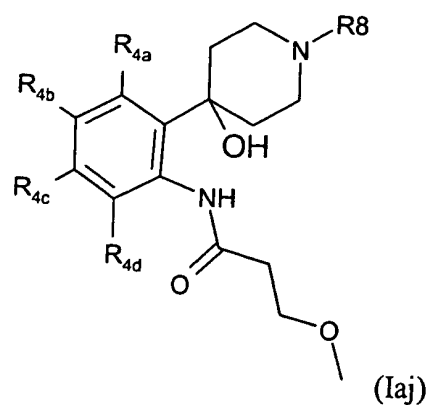
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXXIII 提供 897 個式 Iai 之化合物



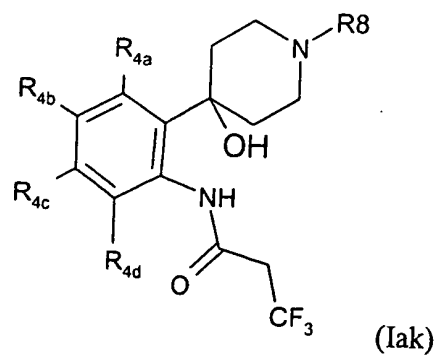
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXXIV 提供 897 個式 Iaj 之化合物



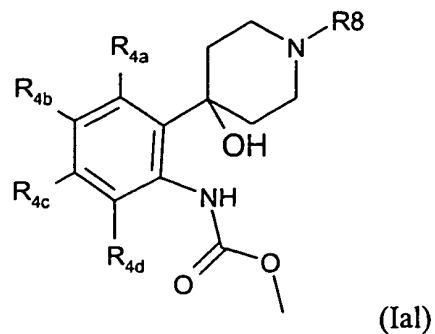
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXXV 提供 897 個式 Iak 之化合物



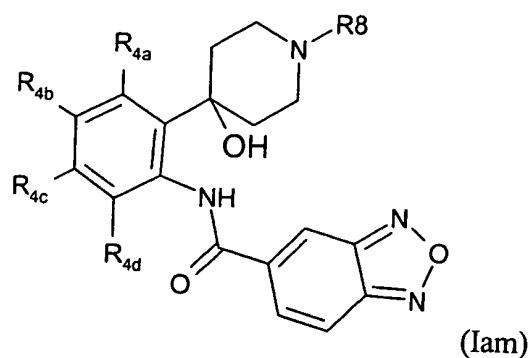
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXXVI 提供 897 個式 IaI 之化合物



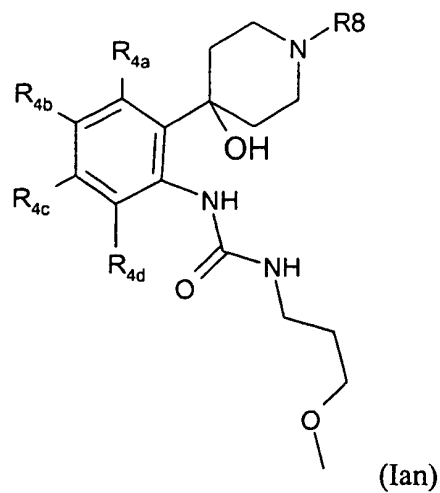
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXXVII 提供 897 個式 IaII 之化合物



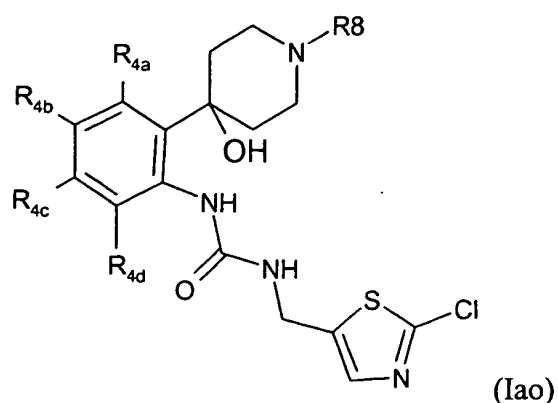
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXXVIII 提供 897 個式 IaIII 之化合物



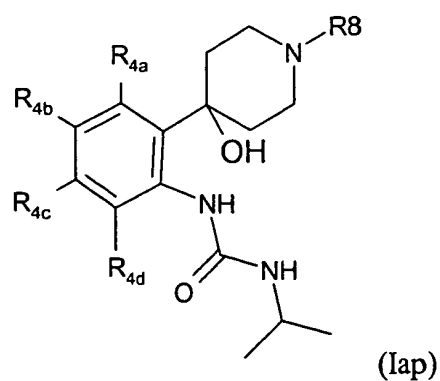
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XXXIX 提供 897 個式 Iao 之化合物



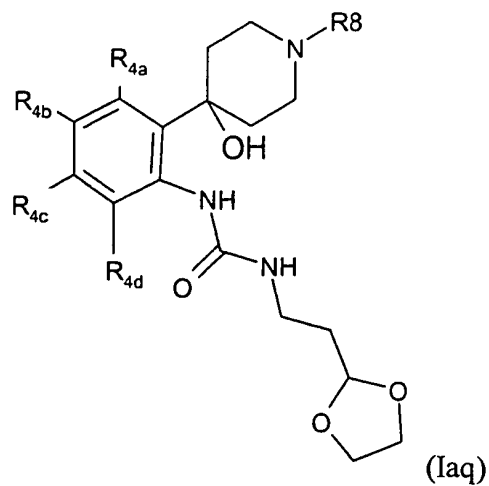
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XL 提供 897 個式 Iap 之化合物



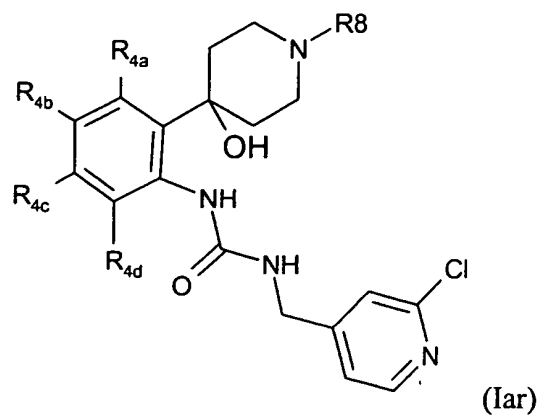
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XLI 提供 897 個式 Ia q 之化合物



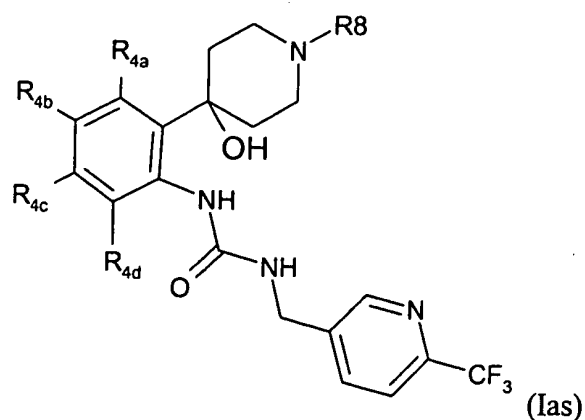
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XLII 提供 897 個式 Iar 之化合物



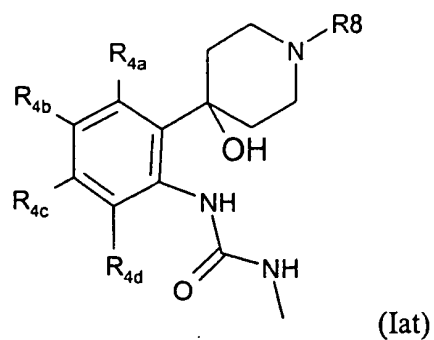
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XLIII 提供 897 個式 Ias 之化合物



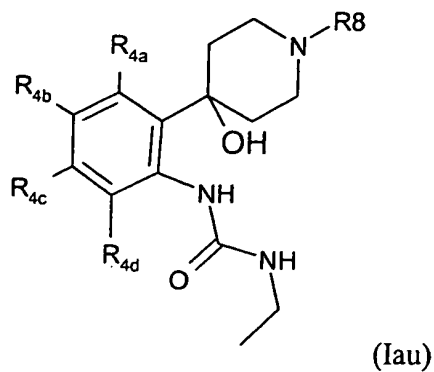
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XLIV 提供 897 個式 Iat 之化合物



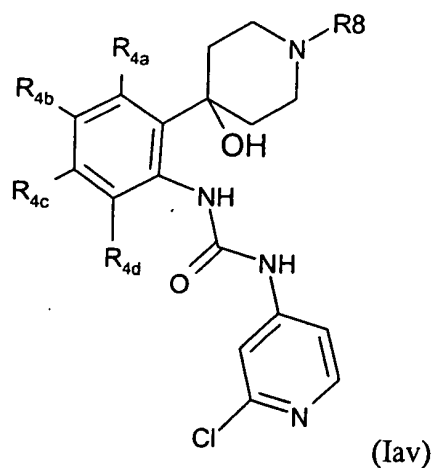
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XLV 提供 897 個式 Iau 之化合物



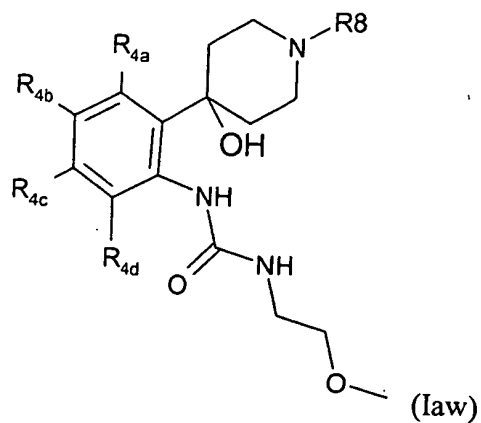
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XLVI 提供 897 個式 Iav 之化合物



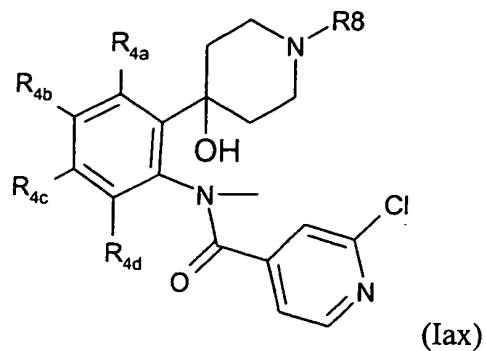
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XLVII 提供 897 個式 Iaw 之化合物



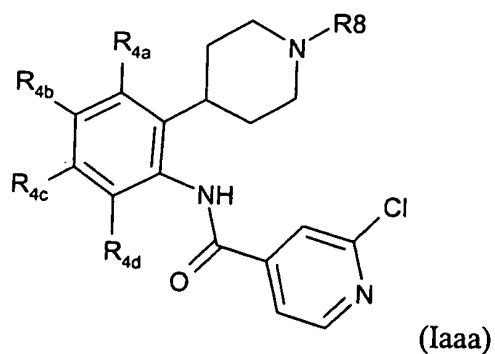
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 XLVIII 提供 897 個式 Iax 之化合物



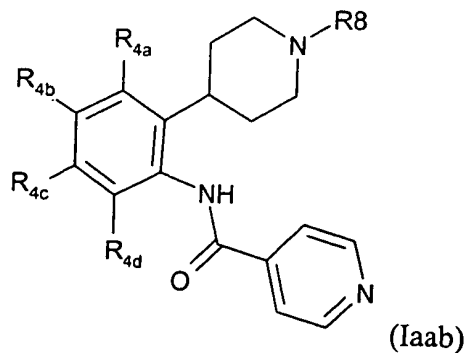
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 IL 提供 897 個式 Iaaa 之化合物



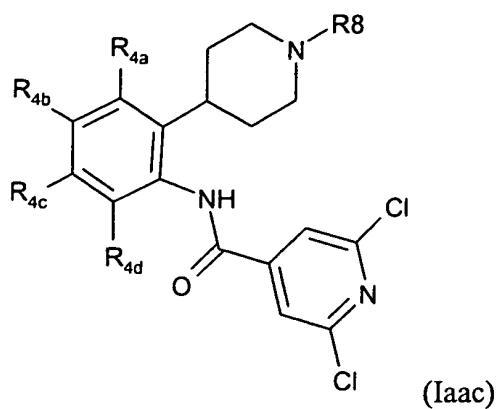
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 L 提供 897 個式 Iaab 之化合物



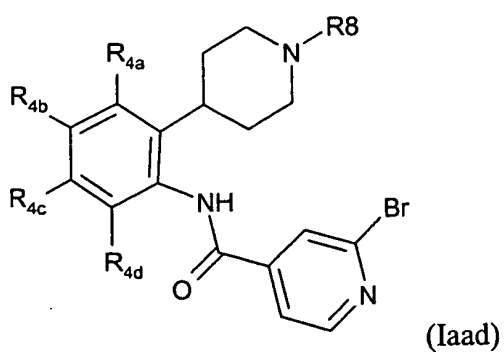
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LI 提供 897 個式 Iaac 之化合物



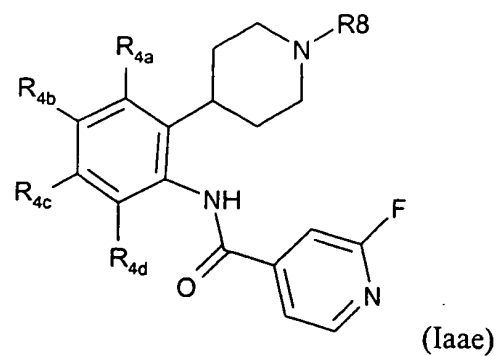
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LII 提供 897 個式 Iaad 之化合物



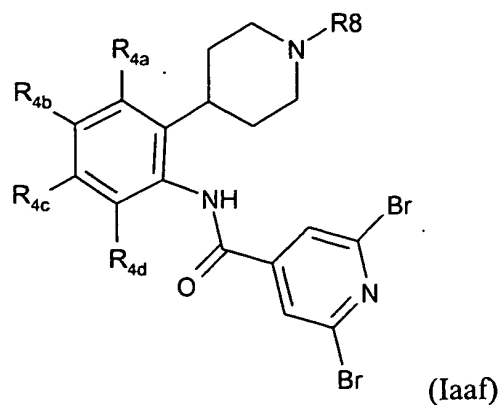
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LIII 提供 897 個式 Iaae 之化合物



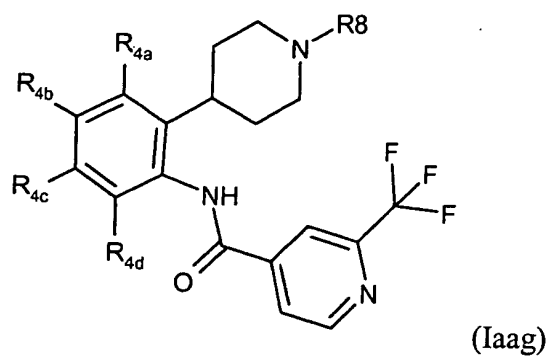
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LIV 提供 897 個式 Iaaf 之化合物



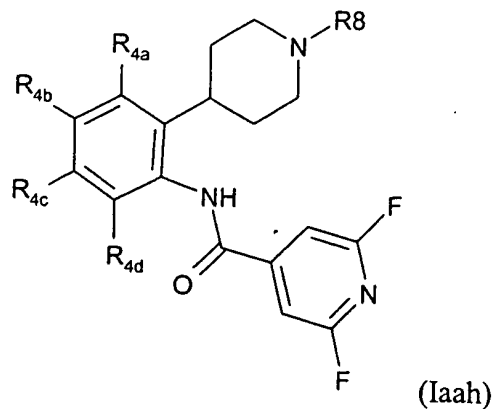
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LV 提供 897 個式 Iaag 之化合物



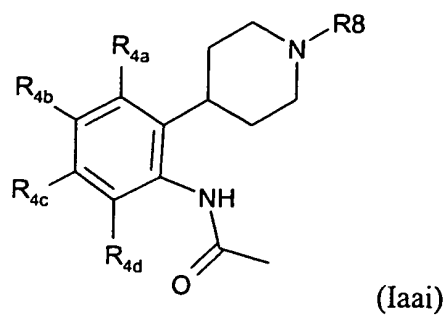
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LVI 提供 897 個式 Iaah 之化合物



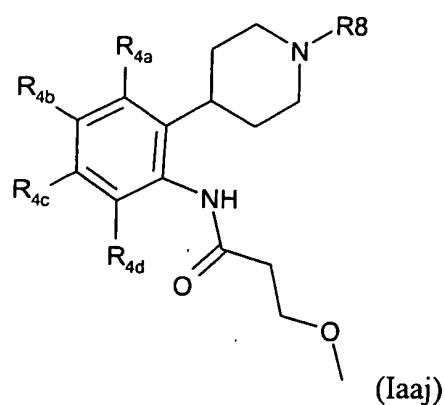
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LVII 提供 897 個式 Iaai 之化合物



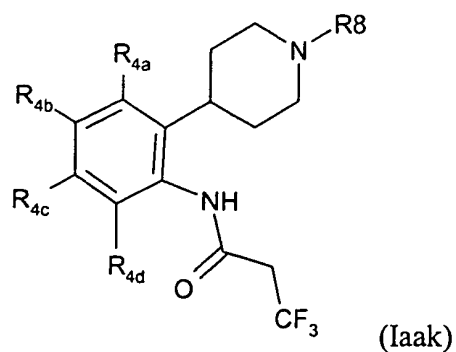
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LVIII 提供 897 個式 Iaaj 之化合物



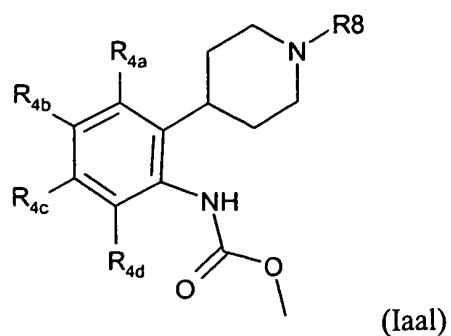
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LIX 提供 897 個式 Iaak 之化合物



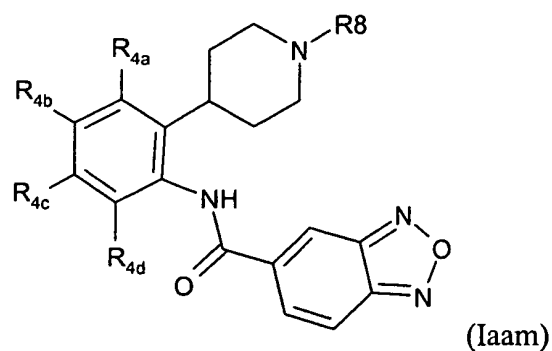
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LX 提供 897 個式 Iaai 之化合物



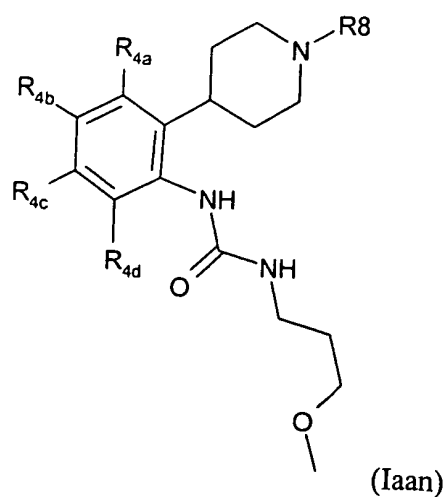
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LXI 提供 897 個式 Iaam 之化合物



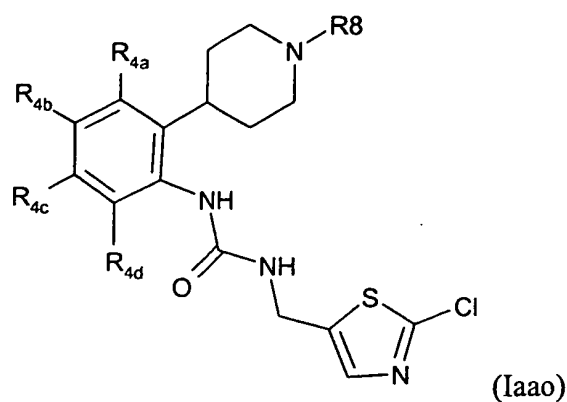
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LXII 提供 897 個式 Iaan 之化合物



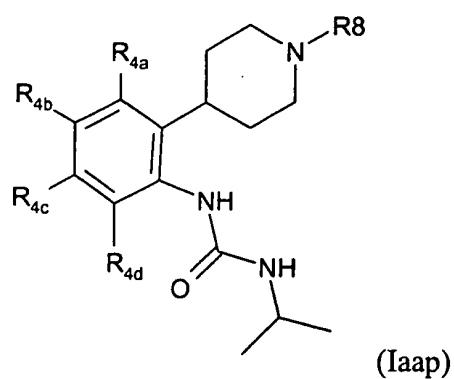
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LXIII 提供 897 個式 Iaao 之化合物



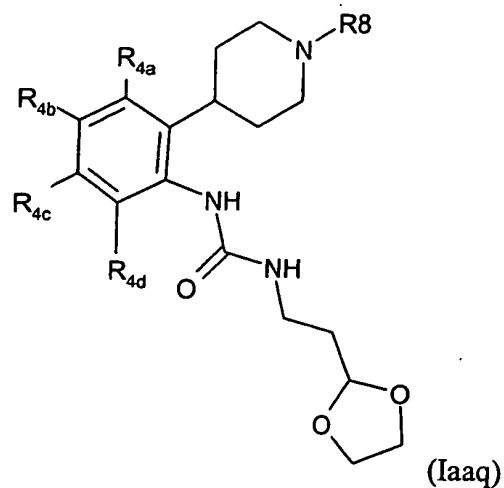
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LXIV 提供 897 個式 Iaap 之化合物



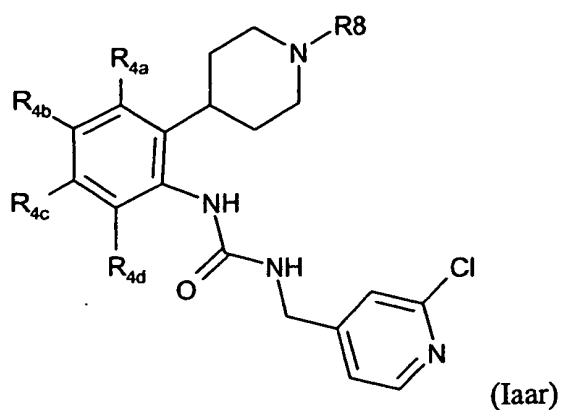
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LXV 提供 897 個式 Iaaq 之化合物



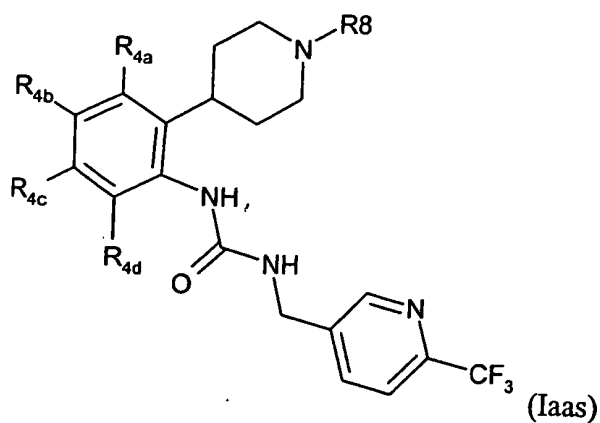
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LXVI 提供 897 個式 Iaar 之化合物



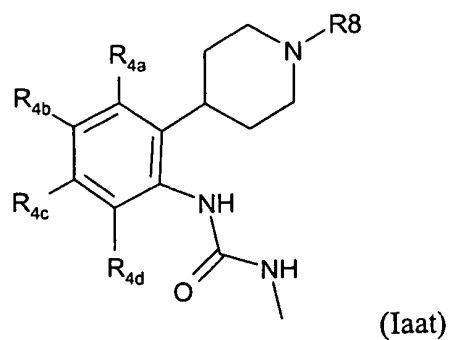
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LXVII 提供 897 個式 Iaas 之化合物



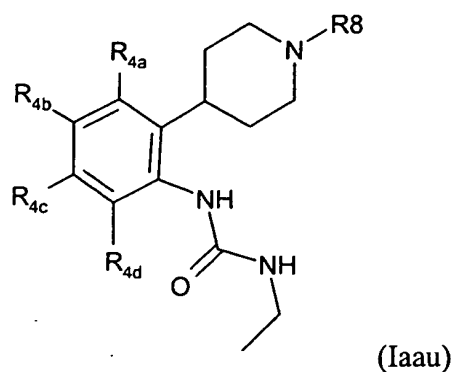
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LXVIII 提供 897 個式 Iaas 之化合物



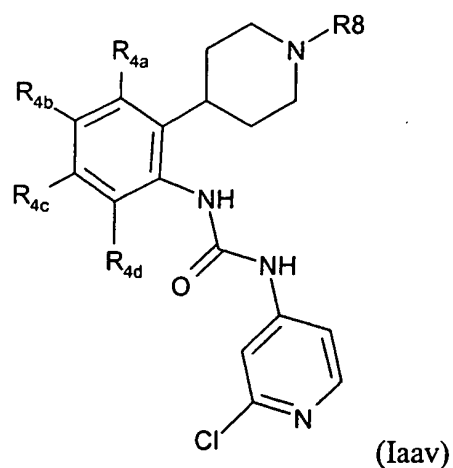
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LXIX 提供 897 個式 Iaau 之化合物



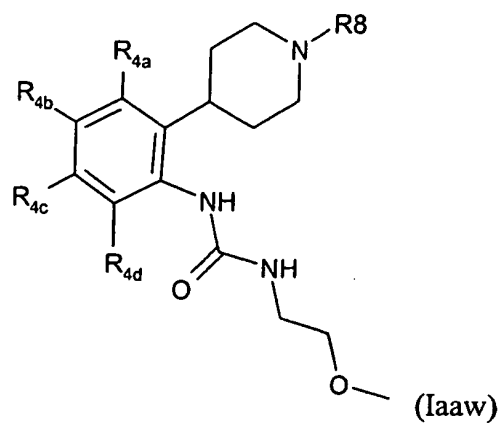
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LXX 提供 897 個式 Iaav 之化合物



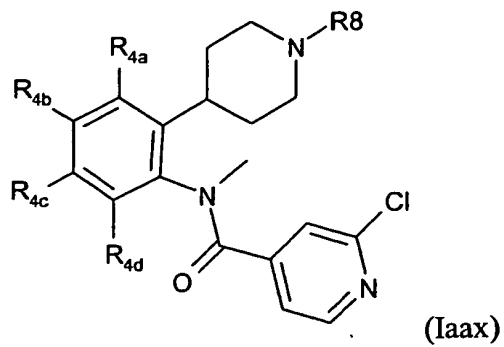
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LXXI 提供 897 個式 Iaaw 之化合物



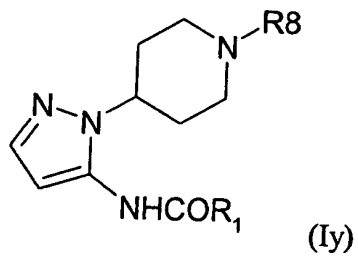
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LXXII 提供 897 個式 Iaax 之化合物



其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 和 R^{4d} 之值給予於表 1 中。

表 LXXIII 提供 897 個式 Iy 之化合物



其中 R^8 和 R^1 之值給予於表 73 中。

表 73

化合物編號	R ⁸	R ¹
LXIII-1	苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-2	4-氯苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-3	4-氯苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-4	4-溴苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-5	4-三氟甲基苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-6	4-三氟甲氧基苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-7	4-五氟乙氧基苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-8	4-甲氧基苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-9	4-乙氧基苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-10	4-氰基苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-11	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-12	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-13	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-14	3-氯基-4-氟基-苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-15	3,5-二氯基-苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-16	5-苯基-戊-2,4-二烯基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-17	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-18	3-萘-2-基-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-19	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-20	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-21	3-吡啶-4-基-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基
LXIII-22	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基

LXIII-23	苯烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-24	4-氯苯烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-25	4-氯苯烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-26	4-溴苯烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-27	4-三氟甲基苯烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-28	4-三氟甲氧基苯烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-29	4-五氟乙氧基苯烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-30	4-甲氧基苯烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-31	4-乙氧基苯烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-32	4-氟基苯烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-33	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-34	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	吡啶-4-基
LXIII-35	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-36	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-37	3,5-二氟基-苯烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-38	5-苯基-戊-2,4-二烯基	吡啶-4-基
LXIII-39	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-40	3-萘-2-基-烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-41	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-42	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-43	3-吡啶-4-基-烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-44	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	吡啶-4-基
LXIII-45	苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-46	4-氯苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基

LXIII-47	4-氟苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-48	4-溴苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-49	4-三氟甲基苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-50	4-三氟甲氧基苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-51	4-五氟乙氧基苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-52	4-甲氧基苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-53	4-乙氧基苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-54	4-氟基苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-55	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-56	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-57	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-58	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-59	3,5-二氟基-苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-60	5-苯基-戊-2,4-二烯基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-61	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-62	3-萘-2-基-烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-63	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-64	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-65	3-吡啶-4-基-烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-66	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-67	苯烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-68	4-氟苯烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-69	4-氟苯烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-70	4-溴苯烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基

LXIII-71	4-三氟甲基苯烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-72	4-三氟甲氧基苯烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-73	4-五氟乙氧基苯烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-74	4-甲氧基苯烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-75	4-乙氧基苯烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-76	4-氟基苯烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-77	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-78	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-79	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-80	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-81	3,5-二氟基-苯烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-82	5-苯基-戊-2,4-二烯基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-83	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-84	3-蔡-2-基-烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-85	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-86	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-87	3-吡啶-4-基-烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-88	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	2-溴基-吡啶-4-基
LXIII-89	苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-90	4-氟基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-91	4-氟基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-92	4-溴基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-93	4-三氟甲基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-94	4-三氟甲氧基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基

LXIII-95	4-五氟乙氧基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-96	4-甲氧基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-97	4-乙氧基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-98	4-氟基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-99	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-100	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-101	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-102	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-103	3,5-二氟基-苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-104	5-苯基-戊-2,4-二烯基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-105	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-106	3-蔡-2-基-烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-107	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-108	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-109	3-吡啶-4-基-烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-110	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基
LXIII-111	苯烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-112	4-氟苯烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-113	4-氟苯烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-114	4-溴苯烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-115	4-三氟甲基苯烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-116	4-三氟甲氧基苯烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-117	4-五氟乙氧基苯烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-118	4-甲氧基苯烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基

LXIII-119	4-乙氧基苯烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-120	4-氟基苯烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-121	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-122	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-123	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-124	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-125	3,5-二氟基-苯烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-126	5-苯基-戊-2,4-二烯基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-127	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-128	3-蔡-2-基-烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-129	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-130	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-131	3-吡啶-4-基-烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-132	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	2,6-二溴基-吡啶-4-基
LXIII-133	苯烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-134	4-氟苯烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-135	4-氟苯烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-136	4-溴苯烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-137	4-三氟甲基苯烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-138	4-三氟甲氧基苯烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-139	4-五氟乙氧基苯烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-140	4-甲氧基苯烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-141	4-乙氧基苯烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-142	4-氟基苯烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基

LXIII-143	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-144	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-145	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-146	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-147	3,5-二氟基-苯烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-148	5-苯基-戊-2,4-二烯基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-149	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-150	3-蔡-2-基-烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-151	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-152	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-153	3-吡啶-4-基-烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-154	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	3-三氟甲基-吡啶-4-基
LXIII-155	苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-156	4-氟苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-157	4-氟苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-158	4-溴苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-159	4-三氟甲基苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-160	4-三氟甲氧基苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-161	4-五氟乙氧基苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-162	4-甲氧基苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-163	4-乙氧基苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-164	4-氟基苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-165	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-166	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	2,6-二氟基-吡啶-4-基

LXIII-167	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-168	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-169	3,5-二氟基-苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-170	5-苯基-戊-2,4-二烯基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-171	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-172	3-萘-2-基-烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-173	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-174	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-175	3-吡啶-4-基-烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-176	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	2,6-二氟基-吡啶-4-基
LXIII-177	苯烯丙基	甲基
LXIII-178	4-氯苯烯丙基	甲基
LXIII-179	4-氟苯烯丙基	甲基
LXIII-180	4-溴苯烯丙基	甲基
LXIII-181	4-三氟甲基苯烯丙基	甲基
LXIII-182	4-三氟甲氧基苯烯丙基	甲基
LXIII-183	4-五氟乙氧基苯烯丙基	甲基
LXIII-184	4-甲氧基苯烯丙基	甲基
LXIII-185	4-乙氧基苯烯丙基	甲基
LXIII-186	4-氟基苯烯丙基	甲基
LXIII-187	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	甲基
LXIII-188	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	甲基
LXIII-189	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	甲基
LXIII-190	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	甲基

LXIII-191	3,5-二氯基-苯烯丙基	甲基
LXIII-192	5-苯基-戊-2,4-二烯基	甲基
LXIII-193	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	甲基
LXIII-194	3-蔡-2-基-烯丙基	甲基
LXIII-195	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	甲基
LXIII-196	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	甲基
LXIII-197	3-吡啶-4-基-烯丙基	甲基
LXIII-198	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	甲基
LXIII-199	苯烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-200	4-氯苯烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-201	4-氯苯烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-202	4-溴苯烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-203	4-三氟甲基苯烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-204	4-三氟甲氧基苯烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-205	4-五氟乙氧基苯烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-206	4-甲氧基苯烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-207	4-乙氧基苯烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-208	4-氯基苯烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-209	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-210	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	甲氧基乙基
LXIII-211	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-212	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-213	3,5-二氯基-苯烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-214	5-苯基-戊-2,4-二烯基	甲氧基乙基

LXIII-215	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-216	3-萘-2-基-烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-217	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-218	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-219	3-吡啶-4-基-烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-220	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	甲氧基乙基
LXIII-221	苯烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-222	4-氯苯烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-223	4-氟苯烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-224	4-溴苯烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-225	4-三氟甲基苯烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-226	4-三氟甲氧基苯烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-227	4-五氟乙氧基苯烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-228	4-甲氧基苯烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-229	4-乙氧基苯烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-230	4-氯基苯烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-231	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-232	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-233	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-234	3-氯基-4-氟基-苯烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-235	3,5-二氯基-苯烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-236	5-苯基-戊-2,4-二烯基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-237	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-238	3-萘-2-基-烯丙基	2,2,2-三氟乙基

LXIII-239	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-240	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-241	3-吡啶-4-基-烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-242	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	2,2,2-三氟乙基
LXIII-243	苯烯丙基	甲氧基
LXIII-244	4-氯苯烯丙基	甲氧基
LXIII-245	4-氯苯烯丙基	甲氧基
LXIII-246	4-溴苯烯丙基	甲氧基
LXIII-247	4-三氟甲基苯烯丙基	甲氧基
LXIII-248	4-三氟甲氧基苯烯丙基	甲氧基
LXIII-249	4-五氟乙氧基苯烯丙基	甲氧基
LXIII-250	4-甲氧基苯烯丙基	甲氧基
LXIII-251	4-乙氧基苯烯丙基	甲氧基
LXIII-252	4-氟基苯烯丙基	甲氧基
LXIII-253	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	甲氧基
LXIII-254	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	甲氧基
LXIII-255	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	甲氧基
LXIII-256	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	甲氧基
LXIII-257	3,5-二氟基-苯烯丙基	甲氧基
LXIII-258	5-苯基-戊-2,4-二烯基	甲氧基
LXIII-259	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	甲氧基
LXIII-260	3-蔡-2-基-烯丙基	甲氧基
LXIII-261	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	甲氧基
LXIII-262	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	甲氧基

LXIII-263	3-吡啶-4-基-烯丙基	甲氧基
LXIII-264	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	甲氧基
LXIII-265	苯烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-266	4-氯苯烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-267	4-氟苯烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-268	4-溴苯烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-269	4-三氟甲基苯烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-270	4-三氟甲氧基苯烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-271	4-五氟乙氧基苯烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-272	4-甲氧基苯烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-273	4-乙氧基苯烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-274	4-氯基苯烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-275	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-276	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-277	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-278	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-279	3,5-二氯基-苯烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-280	5-苯基-戊-2,4-二烯基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-281	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-282	3-蔡-2-基-烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-283	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-284	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-285	3-吡啶-4-基-烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基
LXIII-286	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	2,1,3-苯并𫟇二唑-5-基

LXIII-287	苯烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-288	4-氯苯烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-289	4-氯苯烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-290	4-溴苯烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-291	4-三氯甲基苯烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-292	4-三氯甲氧基苯烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-293	4-五氯乙氧基苯烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-294	4-甲氧基苯烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-295	4-乙氧基苯烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-296	4-氟基苯烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-297	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-298	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	甲氧基丙胺基
LXIII-299	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-300	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-301	3,5-二氯基-苯烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-302	5-苯基-戊-2,4-二烯基	甲氧基丙胺基
LXIII-303	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-304	3-蔡-2-基-烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-305	3-(5-三氯甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-306	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-307	3-吡啶-4-基-烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-308	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	甲氧基丙胺基
LXIII-309	苯烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-310	4-氯苯烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基

LXIII-311	4-氯苯烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-312	4-溴苯烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-313	4-三氯甲基苯烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-314	4-三氯甲氧基苯烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-315	4-五氟乙氧基苯烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-316	4-甲氧基苯烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-317	4-乙氧基苯烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-318	4-氯基苯烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-319	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-320	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-321	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-322	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-323	3,5-二氯基-苯烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-324	5-苯基-戊-2,4-二烯基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-325	4-异丙氧羰胺基-苯烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-326	3-萘-2-基-烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-327	3-(5-三氯甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-328	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-329	3-吡啶-4-基-烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-330	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	2-氯基-噻唑基-5-基
LXIII-331	苯烯丙基	i-丙胺基
LXIII-332	4-氯苯烯丙基	i-丙胺基
LXIII-333	4-氯苯烯丙基	i-丙胺基
LXIII-334	4-溴苯烯丙基	i-丙胺基

LXIII-335	4-三氟甲基苯烯丙基	i-丙胺基
LXIII-336	4-三氟甲氧基苯烯丙基	i-丙胺基
LXIII-337	4-五氟乙氧基苯烯丙基	i-丙胺基
LXIII-338	4-甲氧基苯烯丙基	i-丙胺基
LXIII-339	4-乙氧基苯烯丙基	i-丙胺基
LXIII-340	4-氟基苯烯丙基	i-丙胺基
LXIII-341	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	i-丙胺基
LXIII-342	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	i-丙胺基
LXIII-343	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	i-丙胺基
LXIII-344	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	i-丙胺基
LXIII-345	3,5-二氟基-苯烯丙基	i-丙胺基
LXIII-346	5-苯基-戊-2,4-二烯基	i-丙胺基
LXIII-347	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	i-丙胺基
LXIII-348	3-萘-2-基-烯丙基	i-丙胺基
LXIII-349	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	i-丙胺基
LXIII-350	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	i-丙胺基
LXIII-351	3-吡啶-4-基-烯丙基	i-丙胺基
LXIII-352	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	i-丙胺基
LXIII-353	苯烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-354	4-氟苯烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-355	4-氟苯烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-356	4-溴苯烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-357	4-三氟甲基苯烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-358	4-三氟甲氧基苯烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基

LXIII-359	4-五氟乙氧基苯烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-360	4-甲氧基苯烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-361	4-乙氧基苯烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-362	4-氟基苯烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-363	3-(6-氟基-吡啶-3-基)-烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-364	3-(4-氟苯基)-丁-2-烯基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-365	3-(4-氟苯基)-3-氟基-烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-366	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-367	3,5-二氟基-苯烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-368	5-苯基-戊-2,4-二烯基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-369	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-370	3-蔡-2-基-烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-371	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-372	3-(5-氟基-吡啶-2-基)-烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-373	3-吡啶-4-基-烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-374	3-(2-氟基-吡啶-4-基)-烯丙基	1,3-二噁烷-2-基-乙胺基
LXIII-375	苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-376	4-氟基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-377	4-氟基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-378	4-溴基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-379	4-三氟甲基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-380	4-三氟甲氧基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-381	4-五氟乙氧基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-382	4-甲氧基苯烯丙基	2-氟基-吡啶-4-基-甲胺基

LXIII-383	4-乙氧基苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-384	4-氯基苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-385	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-386	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	2-氯基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-387	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-388	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-389	3,5-二氯基-苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-390	5-苯基-戊-2,4-二烯基	2-氯基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-391	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-392	3-蔡-2-基-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-393	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-394	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-395	3-吡啶-4-基-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-396	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-甲胺基
LXIII-397	苯烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-398	4-氯苯烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-499	4-氯苯烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-400	4-溴苯烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-401	4-三氟甲基苯烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-402	4-三氟甲氧基苯烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-403	4-五氟乙氧基苯烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-404	4-甲氧基苯烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-405	4-乙氧基苯烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-406	4-氯基苯烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基

LXIII-407	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-408	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-409	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-410	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-411	3,5-二氯基-苯烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-412	5-苯基-戊-2,4-二烯基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-413	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-414	3-蔡-2-基-烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-415	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-416	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-417	3-吡啶-4-基-烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-418	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	2-三氟甲基-吡啶-5-基-甲胺基
LXIII-419	苯烯丙基	甲胺基
LXIII-420	4-氯苯烯丙基	甲胺基
LXIII-421	4-氯苯烯丙基	甲胺基
LXIII-422	4-溴苯烯丙基	甲胺基
LXIII-423	4-三氟甲基苯烯丙基	甲胺基
LXIII-424	4-三氟甲氧基苯烯丙基	甲胺基
LXIII-425	4-五氟乙氧基苯烯丙基	甲胺基
LXIII-426	4-甲氧基苯烯丙基	甲胺基
LXIII-427	4-乙氧基苯烯丙基	甲胺基
LXIII-428	4-氯基苯烯丙基	甲胺基
LXIII-429	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	甲胺基
LXIII-430	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	甲胺基

LXIII-431	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	甲胺基
LXIII-432	3-氟基-4-氟基-苯烯丙基	甲胺基
LXIII-433	3,5-二氯基-苯烯丙基	甲胺基
LXIII-434	5-苯基-戊-2,4-二烯基	甲胺基
LXIII-435	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	甲胺基
LXIII-436	3-蔡-2-基-烯丙基	甲胺基
LXIII-437	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	甲胺基
LXIII-438	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	甲胺基
LXIII-439	3-吡啶-4-基-烯丙基	甲胺基
LXIII-440	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	甲胺基
LXIII-441	苯烯丙基	乙胺基
LXIII-442	4-氯苯烯丙基	乙胺基
LXIII-443	4-氟苯烯丙基	乙胺基
LXIII-444	4-溴苯烯丙基	乙胺基
LXIII-445	4-三氟甲基苯烯丙基	乙胺基
LXIII-446	4-三氟甲氧基苯烯丙基	乙胺基
LXIII-447	4-五氟乙氧基苯烯丙基	乙胺基
LXIII-448	4-甲氧基苯烯丙基	乙胺基
LXIII-449	4-乙氧基苯烯丙基	乙胺基
LXIII-450	4-氯基苯烯丙基	乙胺基
LXIII-451	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	乙胺基
LXIII-452	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	乙胺基
LXIII-453	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	乙胺基
LXIII-454	3-氯基-4-氟基-苯烯丙基	乙胺基

LXIII-455	3,5-二氯基-苯烯丙基	乙胺基
LXIII-456	5-苯基-戊-2,4-二烯基	乙胺基
LXIII-457	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	乙胺基
LXIII-458	3-蔡-2-基-烯丙基	乙胺基
LXIII-459	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	乙胺基
LXIII-460	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	乙胺基
LXIII-461	3-吡啶-4-基-烯丙基	乙胺基
LXIII-462	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	乙胺基
LXIII-463	苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-464	4-氯苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-465	4-氯苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-466	4-溴苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-467	4-三氟甲基苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-468	4-三氟甲氧基苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-469	4-五氟乙氧基苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-470	4-甲氧基苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-471	4-乙氧基苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-472	4-氯基苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-473	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-474	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-475	3-(4-氯苯基)-3-氟基-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-476	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-477	3,5-二氯基-苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-478	5-苯基-戊-2,4-二烯基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基

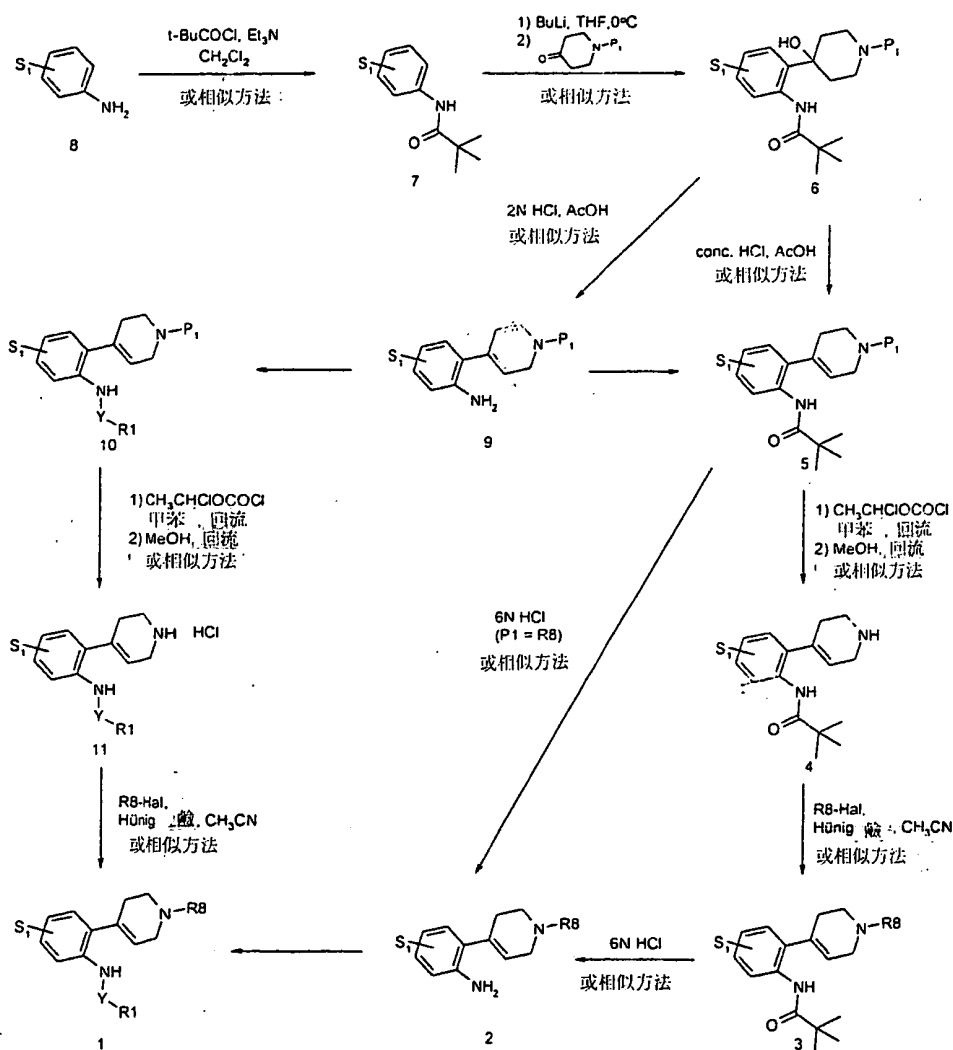
LXIII-479	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-480	3-蔡-2-基-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-481	3-(5-三氯甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-482	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-483	3-吡啶-4-基-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-484	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	2-氯基-吡啶-4-基-胺基
LXIII-485	苯烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-486	4-氯苯烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-487	4-氯苯烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-488	4-溴苯烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-489	4-三氯甲基苯烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-490	4-三氯甲氧基苯烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-491	4-五氯乙氧基苯烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-492	4-甲氧基苯烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-493	4-乙氧基苯烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-494	4-氯基苯烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-495	3-(6-氯基-吡啶-3-基)-烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-496	3-(4-氯苯基)-丁-2-烯基	甲氧基乙胺基
LXIII-497	3-(4-氯苯基)-3-氯基-烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-498	3-氯基-4-氯基-苯烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-499	3,5-二氯基-苯烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-500	5-苯基-戊-2,4-二烯基	甲氧基乙胺基
LXIII-501	4-異丙氧羰胺基-苯烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-502	3-蔡-2-基-烯丙基	甲氧基乙胺基

LXIII-503	3-(5-三氟甲基-吡啶-2-基)-烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-504	3-(5-氯基-吡啶-2-基)-烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-505	3-吡啶-4-基-烯丙基	甲氧基乙胺基
LXIII-506	3-(2-氯基-吡啶-4-基)-烯丙基	甲氧基乙胺基

本發明的化合物可以各種方法製造。

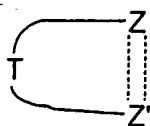
例如通式 1 之四氫吡啶基化合物可根據流程 1 之反應製備。

流程 1



P1 為 R^8 或一種適當保護基例如一種如 BOC、苯甲基或烷基之基及 S_1 為 $(R^4)_n$ 。

流程 1 中所示之合成路徑也可使用於製備一些式 I 之化合物，其中環



為取代苯基之 5 或 6 員雜芳族環。

因此式 1 的化合物可藉由與適當的親電子種類反應而從式 2 的化合物獲得。其中 Y 為羰基的式 1 化合物可藉由式 2 的化合物與式 $R^1-C(O)-Z'$ 的羧酸衍生物(其中 Z' 為氯化物、羥基、烷氧基或鹵氧基)，在 0°C 和 150°C 之間的溫度，視需要選擇地在有機溶劑例如二氯甲烷、氯仿或 1,2-二氯乙烷中，視需要選擇地在三級胺鹼例如三乙胺或二異丙基乙胺的存在下和視需要選擇地在偶合劑例如二環己基碳化二亞胺存在下之反應形成。式 1 化合物(其中 Y 為羰基和 R^1 為一種式 $R'-NH-$ 之胺基取代基)可藉由式 2 的化合物與式 $R'-N=C=O$ 的異氰酸酯在相似條件下之反應而形成。式 1 的化合物(其中 Y 為基 $S(O)_m$ 的基)可藉由在相似條件下以 $R^1-S(O)_m-Cl$ 的化合物處理而從式 2 的化合物形成。式 1 的化合物(其中 Y 為硫羰基和 R^1 為一種式 $R'-NH-$ 之胺基取代基)可藉由式 2 的化合物與式 $R'-N=C=S$ 的異硫氰酸酯在相似條件下之反應而形成。

或者式 1 的化合物(其中 Y 為硫羰基和 R^1 為碳取代基)

可藉由以適當硫化劑(thionating)例如 Lawesson 氏試劑處理式 1 的化合物(其中 Y 為羰基和 R^1 為碳取代基)而形成。

在上述步驟中，式 $R^1-C(O)-Z'$ 的酸衍生物、式 $R'-N=C=O$ 的異氰酸酯、式 $R'-N=C=S$ 之異硫氰酸酯和式 $R^1-S(O)_m-Cl$ 之硫親電子劑為已知化合物或可由熟習該項技術者藉由已知的方法從已知的化合物形成。

式 2 的化合物可根據熟習該項技術者已知的方法藉由醯胺鍵之裂解作用而從式 3 的化合物製備。

或者式 2 之化合物可根據熟習該項技術者已知的方法藉由醯胺鍵之裂解作用而從式 5 的化合物(其中 $P1$ 為 R^8)而製備。

式 3 的化合物可藉由在室溫和 100°C 之間的溫度下，典型地 65°C ，於有機溶劑例如二氯甲烷、氯仿或 1,2-二氯乙烷中、在三級胺鹼例如三乙胺或二異丙基乙胺存在下和視需要選擇地被鹵化物鹽例如碘化鈉、碘化鉀或碘化四丁基銨催化，與式 R^8-L 的烷化劑(其中 L 為氯化物、溴化物、碘化物或磺酸酯(例如甲磺酸酯或甲苯磺酸酯)或相似的離去基)的反應而從式 4 的化合物獲得。或者式 4 的化合物可在室溫和 100°C 之間的溫度下於有機溶劑例如四氫呋喃或乙醇或溶劑的混合物中、在還原劑例如硼烷-吡啶錯合物、硼氫化鈉、(三乙醯氧基)硼氫化鈉、氰基硼氫化鈉或該等相似者存在下與式 R^8-CHO 的醛反應，以產生一種式 3 的化合物，其中 R^8 為 CH_2-R 。

式 4 的化合物可根據熟習該技藝者已知的方法藉由去

烷基化作用而從式 5 的化合物(其中 P1 為苯甲基或烷基)製備。式 4 的化合物可根據熟習該技藝者已知的方法藉由以酸例如 CF_3COOH 處理而從式 5 的化合物(其中 P1 為 BOC)製備。

或者，式 4 的化合物可在 0°C 和 150°C 之間的溫度下選視需要擇地在惰性有機溶劑以於 AcOH 中之 HCl 或 H_2SO_4 處理式 6 化合物(其中 P1 為 BOC)而形成。

式 5 的化合物可根據熟習該技藝者已知的方法藉由 H_2O 脫去反應而從式 6 的化合物(其中 P1 為苯甲基或烷基)製備。最有利的是在 0°C 和 150°C 之間的溫度下以在 AcOH 中之濃 HCl 或 H_2SO_4 處理的式 6 化合物。

或者，式 5 的化合物可根據熟習該技藝者已知的方法以 SOCl_2 處理而從式 6 的化合物製備。

或者。式 5 的化合物可藉由式 9 的化合物與式三級- Bu-C(O)-Z'' 之羧酸衍生物(其中 Z'' 為氯化物、羥基、烷氧基或鹼氧基)在 0°C 和 150°C 之間的溫度下視需要選擇地於惰性有機溶劑中的反應形成。

式 6 的化合物可根據熟習該技藝者已知的方法藉由在 -100°C 和 0°C 之間的溫度下視需要選擇地於之惰性有機溶劑中以吡啶酮處理式 7 的鋰化合物而從式 7 的化合物製備。

式 7 的化合物和式 8 為已知或者可藉由已知的方法從已知的化合物製造。

或者式 1 的化合物可如上述式 3 化合物所述藉由式 11

的化合物之烷基化形成。

式 11 的化合物可根據熟習該技藝者已知的方法藉由去烷基化作用而從式 10 的化合物(其中 P1 為苯甲基或烷基)製備。

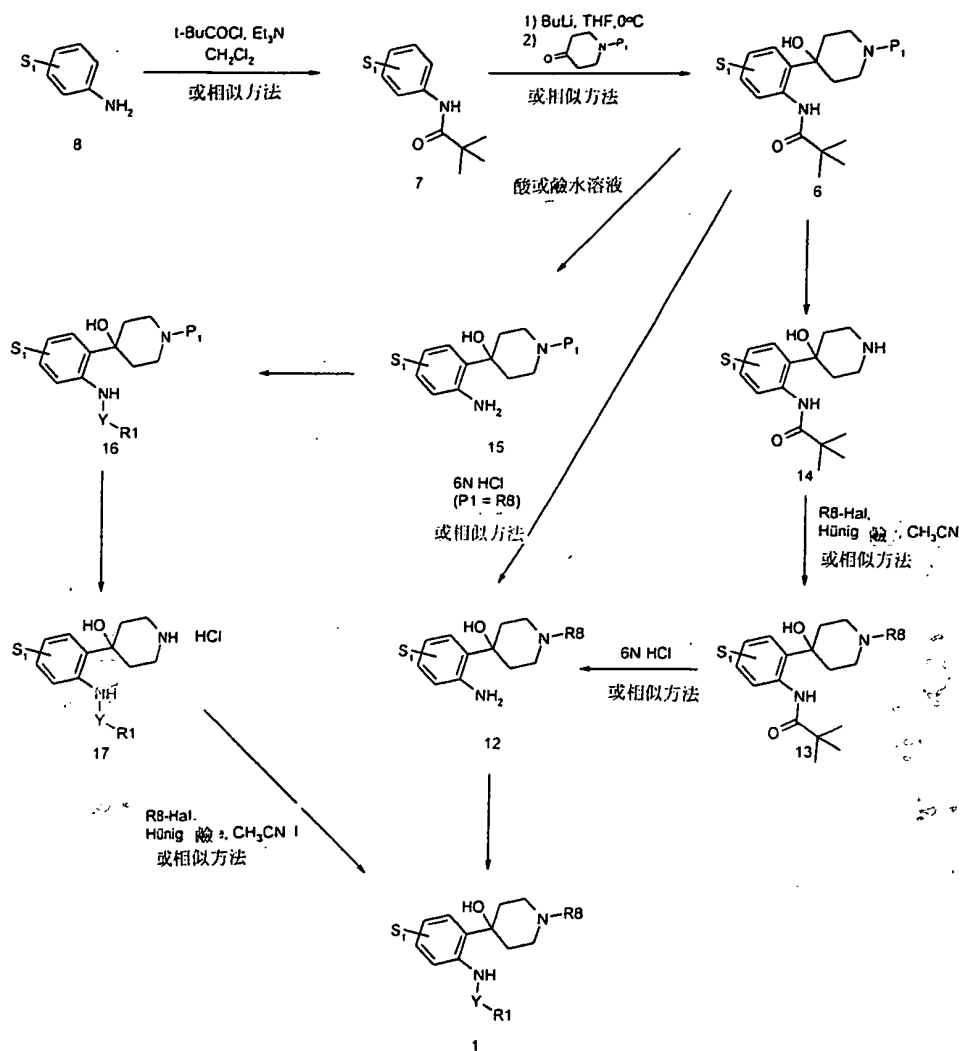
式 10 的化合物可藉由上述式 2 化合物轉化成式 I 化合物所述的方法從式 9 的化合物製備。

式 9 的化合物可根據熟習該技藝者已知的方法藉由 H_2O 脫去反應而從式 6 的化合物製備。最有利的是在 $0^{\circ}C$ 和 $150^{\circ}C$ 之間的溫度下於 AcOH 中以 HCl 或 H_2SO_4 水溶液或在 H_2O 和適當溶劑中以鹼處理的式 6 化合物。

某些式 2、式 3、式 4、式 5、式 6、式 9 式 10 和式 11 的化合物是新穎的且同樣地形成本發明的進一步觀點。

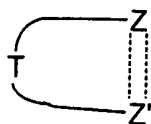
通式 1 的 4-羥基-哌啶基化合物也可根據流程 2 之反應使用熟習該技藝者已知和如上所述的合成方法製備。

流程 2



P_1 為 R^8 或為一種適當保護基例如一種如 BOC、苯甲基或烷基之及 S_1 為 $(\text{R}^4)_n$ 基。

如流程 2 中所示的合成路徑也可用來製備一些式 I 之化合物，其中環

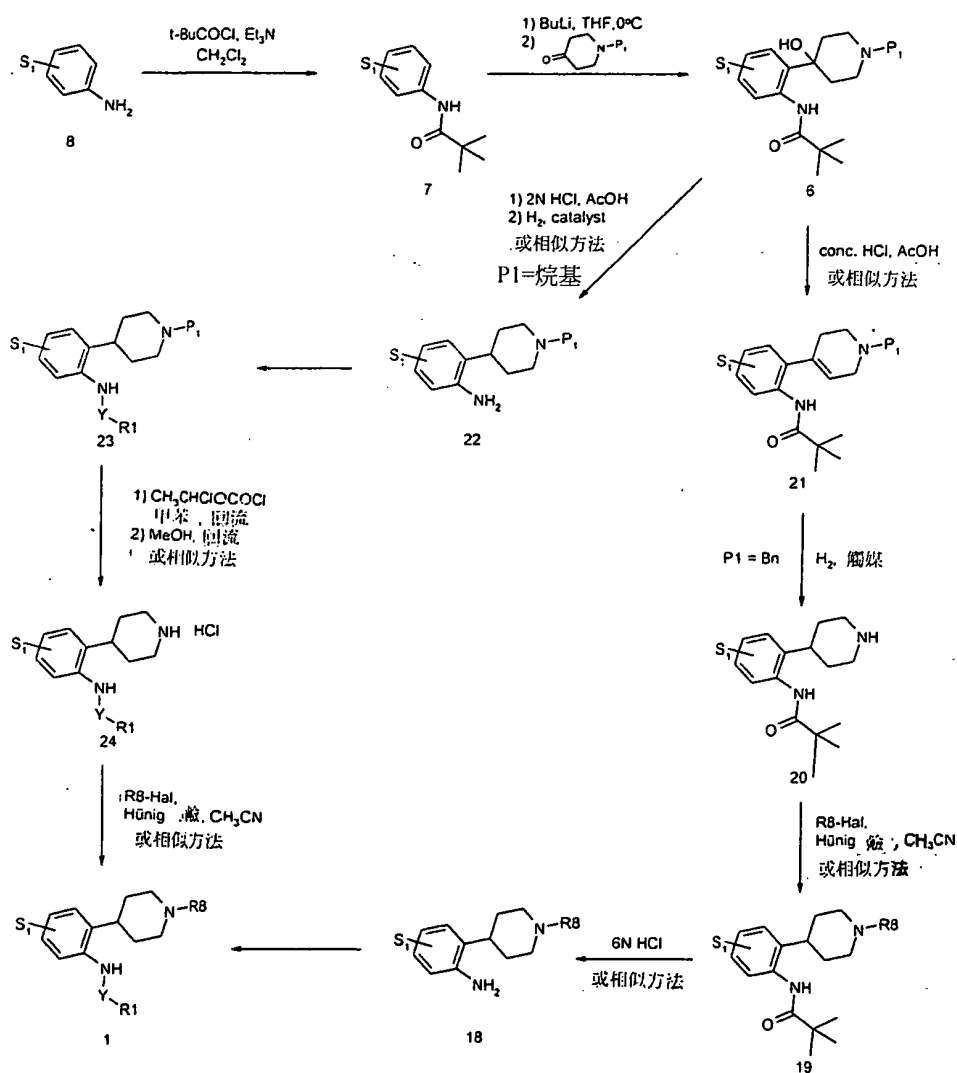


為代替苯基之 5 或 6 員的雜芳環。

某些式 12、式 13、式 14、式 15、式 16 和式 17 的化合物是新穎的且同樣地形成本發明的進一步觀點。

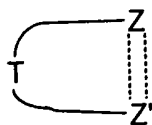
通式 1 之哌啶基化合物可根據流程 3 之反應使用熟習該技藝者已知和如上所述的合成方法製備。

流程 3



P_1 為 R^8 或為一種適當保護基例如一種如 BOC、苯甲基或烷基之及 S_1 為 $(R^4)_n$ 基。

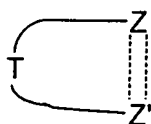
如流程 3 中所示的合成路徑也可用來製備一些式 I 之化合物，其中環



為代替苯基之 5 或 6 員的雜芳環。

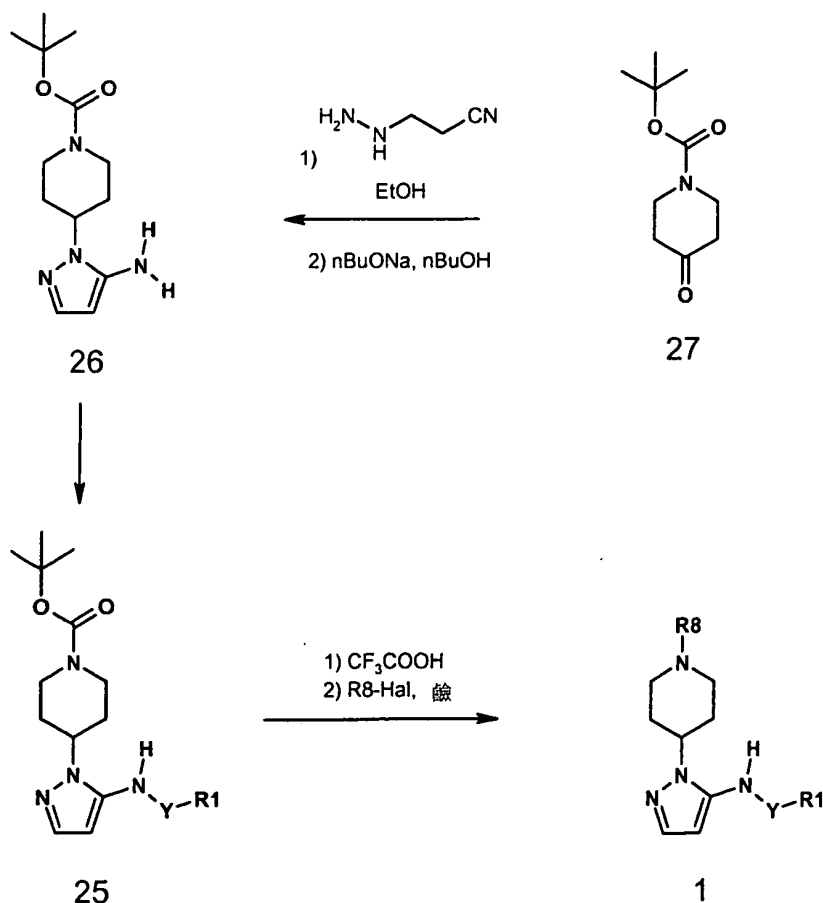
某些式 18、式 19、式 20、式 21、式 22、式 23 和式 24 的化合物是新穎的且同樣地形成本發明的進一步觀點。

化合物，其環



為代替苯基之 5 或 6 員的雜芳環可根據流程 1-3 中所示的路徑或許多其他熟習該技藝者已知的路徑或方法製備，例如 2H-吡唑-3-基衍生物如流程 4 中所示製備。

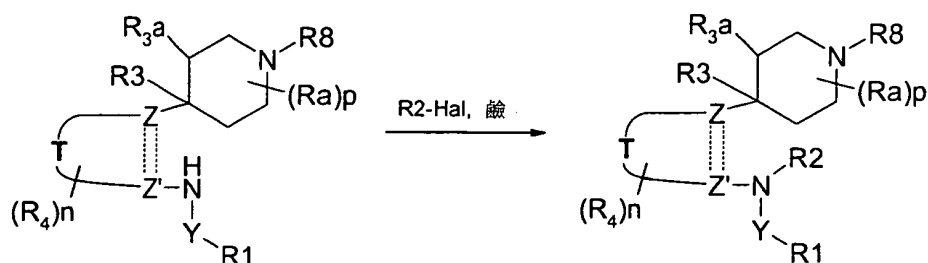
流程 4



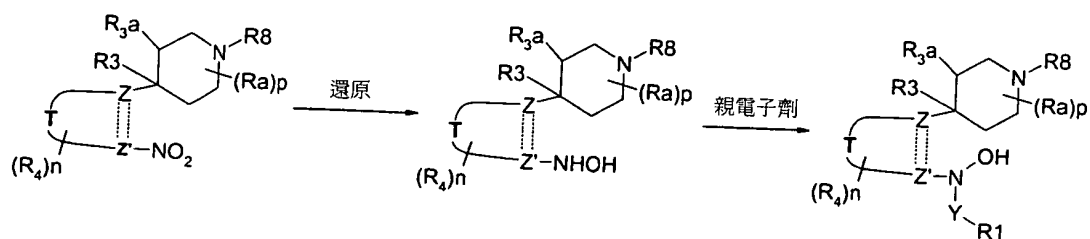
某些式 25 的化合物是新穎的且同樣地形成本發明的進一步觀點。

熟習該技藝者將容易地認知一種式 I 化合物(其中 R2 為 H)或流程 1-4 的中間物轉化成其他式 I 化合物或其中間產物是可能的。該等轉轉變的例子給予在流程 5、6 和 7 中，其中 R 基具有如上述式 I 的化合物所定義之意義。

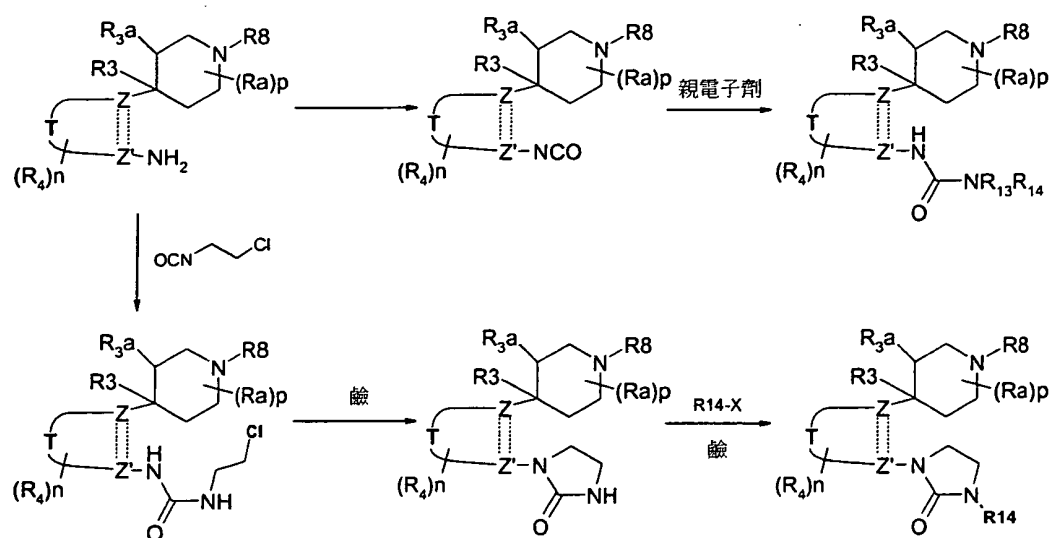
流程 5



流程 6



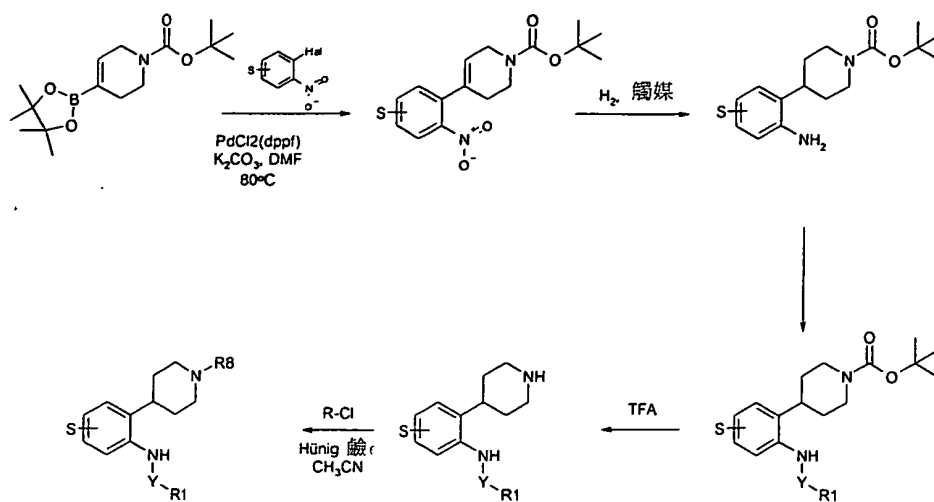
流程 7



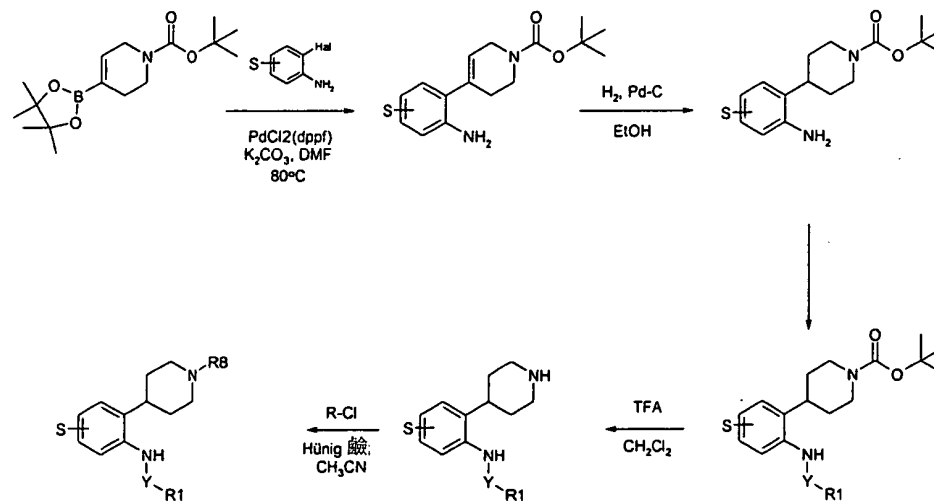
或者通式 1 之吡啶基-苯胺衍生物可根據流程 8-13 的反應使用熟習該技藝者已知和如上所述的合成方法製備，其中 S 為基 (R⁴)_n。

在這些合成路徑中之一主要步驟為製備四氫吡啶-4-基-苯胺衍生物的 Suzuki 偶合反應。可良好地採用其他交叉偶合反應，例如 Stille 和 Negishi 偶合。該等酮酸鹽試劑可如文獻所述製備；例如 P.R Eastwood, THL 41, 3705(2000)。

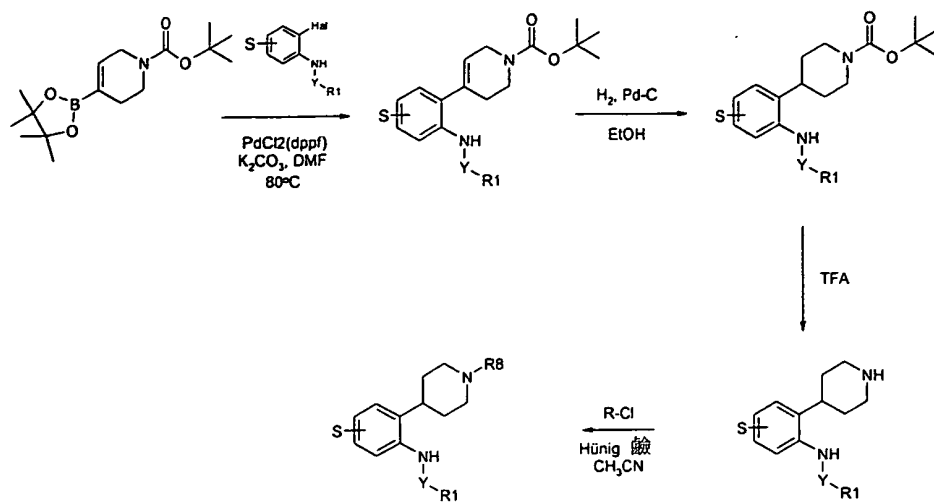
流程 8:



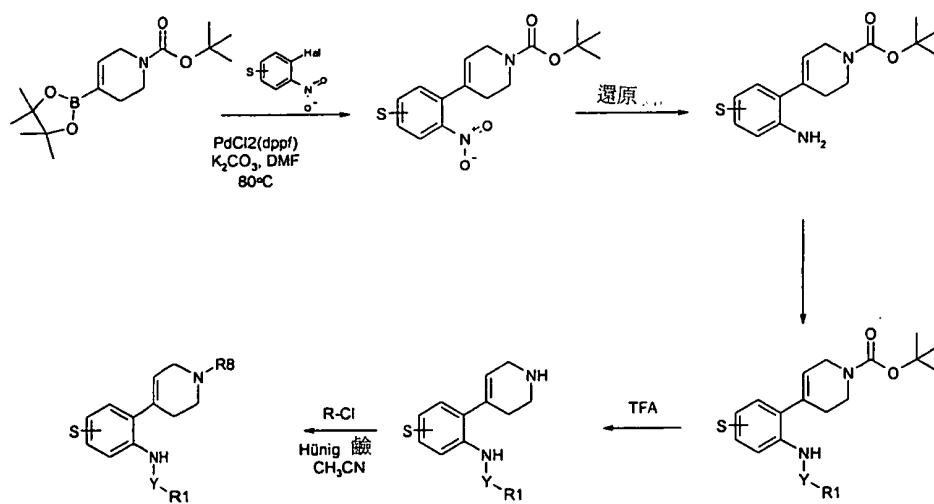
流程 9:



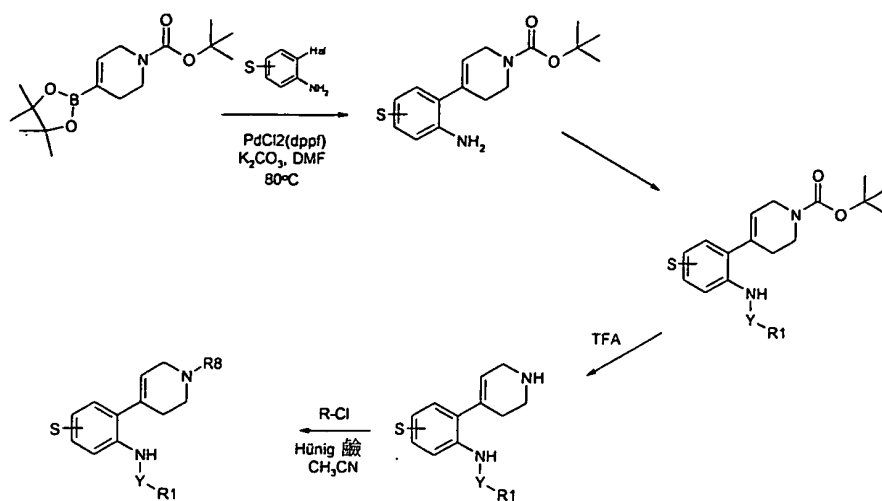
流程 10:



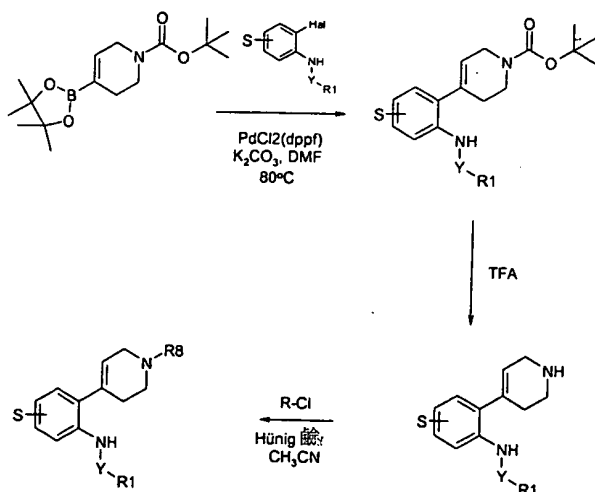
流程 11:



流程 12

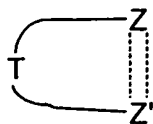


流程 13



可使用其他適當保障基代替 BOC 基。

顯示在流程 8-13 中的合成路徑也可用於式 I 的化合物的製備中，其中環



為代替苯基之 5 或 6 員雜芳環。

式(I)之化合物可用來抵抗及控制昆蟲有害生物例如鱗翅目(Lepidoptera)、雙翅目(Diptera)、半翅目(Hemiptera)、纓翅目(Thysanoptera)、直翅目(Orthoptera)、網翅目(Dictyoptera)、鞘翅目(Coleoptera)、蚤目(Siphonaptera)、膜翅目(Hymenoptera)和等翅目(Isoptera)以及其他的無脊椎有害生物，例如，蟎類、線蟲類和軟體動物有害生物的感染。昆蟲、蟎類、線蟲類和軟體動物在下文中總稱有害生物。該等可藉由使用本發明化合物抵抗和控制的有害生物包括該等與農業(該術語包括食物和纖維產物的農作物之生長)、園藝和動物農事、寵物、林產和蔬菜源(例如水果，穀粒和木材)的產物之儲存有關之有害生物；該等與人造結構的損害及人和動物的疾病傳播有關之有害生物；以及討厭的有害生物(例如蒼蠅)。

可被式(I)之化合物控制的有害生物種類之例子包括：桃蚜(*Myzus persicae*)(蚜蟲)、棉蚜(*Aphis gossypii*)(蚜蟲)、豆蚜(*Aphis fabae*)(蚜蟲)、盲蝽屬(*Lygus* spp.)(盲蝽)、紅椿屬(*Dysdercus* spp.)(盲蝽)、褐飛蟲(*Nilaparvata lugens*)(飛

虱 (planthopper))、黑尾葉蟬 (*Nephotettix incticeps*) (葉蟬 (leafhopper))、綠椿屬 (*Nezara* spp.) (椿象 (stinkbugs))、褐椿屬 (*Euschistus* spp.) (椿象)、緣椿屬 (*Leptocorisa* spp.) (椿象)、西方花蓟馬 (*Frankliniella occidentalis*) (蓟馬)、蓟馬屬 (*Thrips* spp.) (蓟馬)、馬鈴薯甲蟲 (*Leptinotarsa decemlineata*) (科羅拉多馬鈴薯甲蟲 (Colorado potato beetle))、棉象蟲 (*Anthonomus grandis*) (棉象蟲 (boll weevil))、介殼蟲屬 (*Aonidiella* spp.) (介殼蟲)、粉蝨屬 (*Trialeurodes* spp.) (白粉蝨 (white flies))、菸草粉蝨 (*Bemisia tabaci*) (白粉蝨)、歐洲玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*) (歐洲玉米螟)、海灰翅夜蛾 (*Spodoptera littoralis*) (棉葉蟲 (cotton leafworm))、菸草青蟲 (*Heliothis virescens*) (煙夜蛾 (tobacco budworm))、玉米穗蟲 (*Helicoverpa armigera*) (棉鈴蟲)、美洲棉鈴蟲 (*Helicoverpa zea*) (棉鈴蟲)、棉捲葉螟 (*Sylepta derogata*) (棉捲葉蟲)、大菜粉蝶 (*Pieris brassicae*) (白粉蝶)、小菜蛾 (*Plutella xylostella*) (吊絲蟲 (diamond back moth))、地老虎屬 (*Agrotis* spp.) (切根蟲)、二化螟蟲 (*Chilo suppressalis*) (稻鑽心蟲)、飛蝗 (*Locusta migratoria*) (蝗蟲)、澳洲蝗蟲 (*Chortiocetes terminifera*) (蝗蟲)、條葉甲屬 (*Diabrotica* spp.) (根蟲)、蘋果全爪蹣 (*Panonychus ulmi*) (歐洲紅蹣)、柑橘全爪蹣 (*Panonychus citri*) (柑桔葉蹣)、二點葉蹣 (*Tetranychus urticae*) (二點葉蹣 (two-spotted spider mite))、紅葉蹣 (*Tetranychus cinnabarinus*) (紅蜘蛛 (carmine spider mite))、柑桔銹蟬 (*Phyllocoptruta oleivora*) (柑桔鏽壁

蟲(citrus rust mite))、側多食跗線蟎(Polyphagotarsonemus
 latus)(細蟎)、短鬚蟎屬(Brevipalpus spp.)(平蟎(flat
 mites))、牛壁蝨(Boophilus microplus)(牛蚤)、狗壁蝨
 (Dermacentor variabilis)(美洲狗蚤)、貓蚤(Ctenocephalides
 felis)(貓蚤)、斑潛蠅屬(Liriomyza spp.)(潛葉蟲
 (leafminer))、家蠅(Musca domestica)(家蠅)、埃及斑蚊(Aedes
 aegypti)(蚊蟲)、瘧蚊屬(Anopheles Spp.)(蚊蟲)、家蚊屬
 (Culex Spp.)(蚊蟲)、綠頭蒼蠅屬(Lucillia spp.)(麗蠅
 (blowflies))、德國蟑螂(Blattella germanica)(蟑螂)、美洲
 蟑螂(Periplaneta americana)(蟑螂)、東方蟑螂(Blatta
 orientalis)(蟑螂)、澳白蟻科(Mastotermitidae)(例如
 Mastotermes spp.)、蘋白蟻科(Kalotermitidae)(例如新白蟻
 屬(Neotermes spp.))、鼻白蟻科(Rhinotermitidae)(例如家白
 蟻(Coptotermes formosanus)、黃胸散白蟻(Reticulitermes
 flavipes)、R. speratu、R. virginicus、西方犀白蟻(R. hesperus)
 和桑特散白蟻(R. santonensis))和白蟻科(Termitidae)(例如
 黃球土白蟻(Globitermes sulphureus))之白蟻、熱帶火蟻
 (Solenopsis geminata)(火蟻)、小黃家蟻(Monomorium
 pharaonis)(法老蟻)、毛蝨屬(Damalinia spp.)和長顎虱屬
 (Linognathus spp.)(羽虱(biting lice)和血虱(sucking lice))、
 根瘤線蟲(Meloidogyne spp.)(根瘤線蟲)、包囊線蟲
 (Globodera spp.)和包囊線蟲(Heterodera spp.)(囊胞線蟲)、
 根腐線蟲屬(Pratylenchus spp.)(壞疽線蟲(lesion
 nematodes))、Rhodopholus spp.(香蕉穿孔線蟲)、半穿刺蟲

屬 (*Tylenchulus* spp.)(柑桔線蟲)、捻轉胃蟲 (*Haemonchus contortus*)(理發標線蟲 (barber pole worm))、克氏蛔蟲 (*Caenorhabditis elegans*)_(醋小線蟲 (vinegar eelworm))、毛圓線蟲屬 (*Trichostrongylus* spp.)(消化道線蟲)和庭院灰蛭蟪 (*Deroceras reticulatum*)(蛭蟪)。

本發明因此提供一種抵抗及控制昆蟲、蟎類、線蟲類或軟體動物的方法，其包含將殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量的式(I)化合物，或一種包含式(I)化合物之組成物施用到有害生物、有害生物的區域或易受有害生物侵襲之植物。較佳使用式(I)之化合物以抵抗昆蟲、蟎類或線蟲類。

術語“植物”如使用在本文中包括苗木、灌木和樹。

為了將式(I)之化合物以殺蟲劑、殺蟎劑、殺線蟲劑或殺軟體動物劑施用到有害生物、有害生物的區域或易受有害生物侵襲的植物，通常將式(I)之化合物調配成組成物，其除式(I)化合物之外，包括適當惰性稀釋劑或載體和，視需要選擇地，界面活性劑(SFA)。SFA 等為能夠藉由降低界面張力修正界面(例如，液體／固體，液體／空氣或液體／液體界面)之性質和藉此導致其他性質(例如分散、乳化和濕潤)的改變之化學品。最好所有的組成物(固體和液態調配物兩者)包含(以重量計)0.0001到95%(更佳1到85%，例如5到60%)之式(I)化合物。通常以每公頃從0.1克到10公斤，較佳每公頃從1克到6公斤，更佳每公頃從1克到1公斤的比率施用式(I)之化合物而使用組成物來控制有害

生物。

當使用於浸種時，式(I)之化合物以每公斤種子 0.0001 克到 10 克(例如 0.001 克或 0.05 克)，較佳 0.005 克到 10 克，更佳 0.005 克到 4 克的比率使用。

在另一觀點中本發明提供一種殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物組成物，其包含殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量的式(I)化合物和適當載體或稀釋劑。組成物較佳為一種殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物組成物。

在另一觀點中本發明提供一種在一區域中抵抗及控制有害生物的方法，其包含以殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量的包含式(I)化合物之組成物處理有害生物或有害生物的區域。較佳使用式(I)化合物抵抗昆蟲、蟎類或線蟲類。

組成物可選擇許多的調配物類型，包括粉劑(DP)、可溶性粉劑(SP)、水溶性粒劑(SG)、水分散性粒劑(WG)、可濕性粉劑(WP)、粒劑(GR)(慢或快速釋放)、溶解濃縮液(SL)、油溶性液體(OL)、超低體積液體(UL)、乳劑(EC)、分散性濃縮液(DC)、乳液(水包油型(EW)和油包水型(EO)兩者)、微-乳液(ME)、水懸劑(SC)、氣溶膠、霧／煙調配物、膠囊懸浮液(CS)和種子處理調配物。在任何例子中所選擇的調配物類型將視所預見之特殊目的和式(I)化合物的物理、化學和生物的性质而定。

粉劑(DP)可藉由混合式(I)之化合物與一或多種固體稀釋劑(例如天然黏土、高嶺土、葉臘石、膨潤土、氧化鋁、

微晶高嶺土、矽藻土(kieselguhr)、白堊、矽藻土(diatomaceous earths)、磷酸鈣、碳酸鈣和鎂、硫、石灰、岩粉、滑石和其他有機和無機固體載體)及將混合物機械磨到細粉而製備。

可溶性粉劑(SP)可藉由混合式(I)之化合物與一或多種水溶性無機鹽(例如碳酸氫鈉、碳酸鈉或硫酸鎂)或一或多種水溶性有機固體(例如多醣)和，視需要選擇地，改良水分散性／溶解度之一或多種濕潤劑、一或多種的分散劑或該等試劑的混合物而製備。混合物然後磨成細粉。相似的組成物也可被製粒以形成水溶性粒劑(SG)。

可濕性粉劑(WP)可藉由混合式(I)之化合物與一或多種固體稀釋劑或載體、一或多種濕潤劑、和，較佳，促進在液體中的分散之一或多種的分散劑和，視需要選擇地，一或多種的懸浮劑而製備。混合物然後磨成細粉。相似的組成物也可被製粒以形成分散性粒劑(WG)。

粒劑(GR)可藉由將式(I)化合物和一或多種粉末固體稀釋劑或載體的混合物製粒，或藉由式(I)化合物(或其溶液，在適當試劑中)吸收在多孔粒狀材料(例如浮石、綠坡縷石黏土、漂白土、矽藻土(kieselguhr)、矽藻土(diatomaceous earths)或研碎玉米梗)或藉由式(I)化合物(或其溶液，在適當試劑中)吸附在硬核心材料(例如砂、矽酸鹽、礦物碳酸鹽、硫酸鹽或磷酸鹽)上和如果需要的話乾燥而從預先形成的空白顆粒形成。普遍使用於幫助吸收或吸附的試劑包括溶劑(例如脂族和芳族石油溶劑、醇類、醚類、酮類和酯類)

和黏著劑(例如聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇、糊精、糖和蔬菜油類)。一或多種其他的添加劑也可包含在粒劑中(例如乳化劑、濕潤劑或分散劑)。

分散性濃縮液(DC)可藉由將式(I)之化合物溶解在水或有機溶劑，例如酮類、醇類或二醇醚中而製備。這些溶液可包含界面活性劑(例如改良水稀釋或防止在噴灑箱中結晶)。

乳劑(EC)或水包油型乳液(EW)可藉由將式(I)之化合物溶解在有機溶劑(視需要選擇地包含一或多種濕潤劑、一或多種的乳化劑或該等試劑的混合物)中而製備。用於 EC 中的適當有機溶劑包括芳烴類(例如烷基苯類或烷基萘類，以 SOLVESSO 100、SOLVESSO 150 和 SOLVESSO 200 為例；SOLVESSO 為註冊商標)、酮類(例如環己酮或甲基環己酮)和醇類(例如苯甲醇、糠醇或丁醇)、N-烷基吡咯啉酮類(例如 N-甲基吡咯啉酮或 N-辛基吡咯啉酮)、脂肪酸的二甲基鹽胺類(例如 C₈-C₁₀ 脂肪酸二甲基鹽胺)和氯化烴類。EC 產物在加到水中時自然地乳化，以產生具有允許經由適當裝備噴灑施用之足夠穩定性之乳液。EW 的製備包括獲得液體(如果其在室溫下不是液體，其可在合理的溫度下，典型地在 70°C 以下熔化)或溶液(藉由將其溶解在適當溶劑中)的式(I)化合物及然後在高剪切下將所得液體或溶液乳化於包含一或多種 SFA 之水中，以產生乳液。使用於 EW 中的適當溶劑包括蔬菜油類、氯化烴類(例如氯苯)、芳族溶劑(例如烷基苯類或烷基萘類)和其他的在水中具有低溶解度之適

當有機溶劑。

微乳液(ME)可藉由混合水與一或多種溶劑與一或多種SFA的摻合物製備，以自然地產生熱力學穩定之各向同性液態調配物。式(I)之化合物最初以水或溶劑/SFA摻合物存在。使用於ME中的適當溶劑包括該等上述使用於EC或EW之溶劑。ME可為水包油型或油包水型系統(該系統存在可藉由導電率測量測定)和可適合於混合在相同調配物中之水溶性和油溶性除害劑。ME適合稀釋於水中，或保持微乳液或形成一種習知水包油型乳劑。

水懸劑(SC)可包含式(I)化合物的細碎不溶解固體粒子之水或非水懸浮液。SC可藉由在適當介質中球或珠磨式(I)的固體化合物，視需要選擇地與一或多種分散劑，以產生化合物的細粒懸浮液而製備。一或多種濕潤劑可包含在組成物中及可包括懸浮劑以減少粒子沉降的速率。或者，式(I)化合物可乾磨和加至水中，包含上述試劑，以產生所要的最終產物。

氣溶膠調配物包含式(I)化合物和適當的推進劑(例如正-丁烷)。式(I)之化合物也可溶解或分散在適當介質(例如水或水相容液體，例如正-丙醇)以提供使用於非加壓手動噴灑泵之組成物。

式(I)化合物可以乾燥狀態與煙火(pyrotechnic)混合物混合以形成一種適合於在封閉空間中產生包含化合物的煙之組成物。

膠囊懸浮液(CS)可藉由類似於製備EW調配物的方法

製備，但具有額外聚合階段以使獲得油滴的水分散液，其中每個油滴以聚合殼包封且包含式(I)之化合物和因此，視需要選擇地，載體或稀釋劑。聚合殼可藉由界面縮聚反應或藉由凝聚步驟產生。該等組成物可提供式(I)化合物的控制釋放和他們可用於種子處理。式(I)之化合物也可調配成生物可分解物聚合基質以提供化合物的緩慢控制釋放。

組成物可包括一或多種的添加劑以改良組成物的生物效能(例如藉由改良表面的濕潤、滯留或分佈；處理表面的抗雨性；或式(I)化合物的吸收或可動性)。該等添加劑包括界面活性劑，以油(例如某些礦物油類或天然植物油類(例如大豆和油菜子油))為基之噴霧添加劑，和這些與其他的生物-提高之佐藥(可幫助或修正式(I)化合物之作用的成分)摻合。

也可調配式(I)之化合物以用作種子處理，例如粉末組成物，包括乾式種子處理之粉劑(DS)、水溶性粉劑(SS)或用於漿液處理的水分散性粉劑(WS)，或液態組成物，包括可流動濃縮液(FS)、溶液(LS)或膠囊懸浮液(CS)。DS、SS、WS、FS和LS組成物之製備分別與上述該等DP、SP、WP、SC和DC組成物之製備非常相似。處理種子的組成物可包括一種幫助成分黏著至種子之試劑(例如礦物油或形成障壁之薄膜)。

濕潤劑、分散劑和乳化劑可為陽離子、陰離子、兩性或非離子型之表面SFA。

適當之陽離子型SFA包括四級銨化合物(例如溴化十

六烷基三甲基銨)、咪唑啉類和胺鹽類。

適當的陰離子 SFA 包括脂肪酸的鹼金屬鹽、硫酸之脂族單酯的鹽(例如硫酸月桂酯鈉)、磺酸化芳族化合物之鹽(例如十二烷基苯磺酸鈉、十二烷基苯磺酸鈣、丁基萘磺酸鹽和二-異丙基-和三-異丙基-萘磺酸鈉的混合物)、醚硫酸鹽、醇醚硫酸鹽(例如月桂醇-3-硫酸鈉)、醚羧酸鹽(例如月桂醇-3-羧酸鈉)、磷酸酯(在一或多種的脂肪醇和磷酸(主要單-酯)或五氧化磷(主要二-酯)之間的反應(例如在月桂醇和四磷酸之間的反應)之產物;額外地這些產物可被乙氧基化)、磺酸基琥珀醯胺酸鹽、石蠟或烯烴磺酸鹽類、牛磺酸鹽類和木質磺酸鹽類。

適當之兩性型 SFA 包括甜菜鹼類、丙酸鹽類和甘酸鹽類。

適當之非離子型 SFA 包括氧化烯(例如氧化乙烯、氧化丙烯、氧化丁烯或其混合物)與脂肪醇(例如油醇或十六碳醇)或與烷基酚(例如辛酚、壬酚或辛基甲苯酚)的縮合產物;從長鏈脂肪酸或己糖醇酸酐獲得之部分酯;該部分酯與氧化乙烯的縮合產物;嵌段共聚物(包含氧化乙烯和氧化丙烯);烷醇醯胺類;簡單的酯類(例如脂肪酸聚乙二醇酯類);氧化胺類(例如月桂基二甲基氧化胺);和卵磷脂。

適當的懸浮劑包括親水性膠體(例如多醣、聚乙烯吡咯啶酮或羧甲基維維素鈉)和膨脹黏土(例如膨潤土或綠坡縷石)。

式(I)之化合物可藉由任何一種施用除害化合物的已知

方法施用。例如，其可被施用(經調配或未經調配)至有害生物或至有害生物的區域(例如有害生物的棲息地，或易被有害生物感染之成長植物)或到植物的任何部份，包括葉、莖、枝或根，到種子，在其種植之前或到其他植物在其中成長或種植的介質(例如包圍根的土壤、通常土壤、稻田水或水耕系統)，直接地或其可被噴灑在土壤或水環境上、灑粉在土壤或水環境上、藉由浸漬施用，以乳膏或漿料調配物施用，以蒸汽施用或經由組成物(例如粒狀組成物或包裝在水溶性袋子中之組成物)撒佈或合併於土壤或水環境中施用。

式(I)之化合物也可注入植物內或者使用電動噴灑技術或其他低體積方法噴灑在植物上，或藉由陸地或空中的灌溉系統施用。

以水製劑(水溶液或分散液)使用的組成物通常以包含高比例的活性成分之濃縮液的形式供應，濃縮液在使用之前加至水中。這些濃縮液，可包括 DC、SC、EC、EW、ME、SG、SP、WP、WG 和 CS，時常需要延長時間的耐儲存性和，在該儲存之後，能夠加到水中以形成水製劑，其保持均勻一段使他們能夠藉由習知噴灑裝備施用的充份時間。該等水製劑可包含視他們將被使用之目的而改變的量之式(I)化合物(例如 0.0001 到 10%，以重量計)。

式(I)之化合物可以與肥料(例如含氮-，鉀-或磷-肥料)的混合物使用。適當調配物類型包括肥料的顆粒。混合物合適地包含高達 25 重量%的式(I)化合物。

本發明因此也提供一種肥料組成物，其包含肥料和式(I)之化合物。

本發明的組成物可包含其他的具有生物活性之化合物，例如具有殺真菌劑活性或具有植物生長調節、除草、殺蟲、殺線蟲或殺螨活性之微量營養或化合物。

式(I)之化合物可為組成物之唯一活性成分，或其可與一或多種額外活性成分例如除害劑、殺真菌劑、增效劑、除草劑或植物生長調節劑混合，若適當的話。額外活性成分可：提供一種具有較廣範圍的活性或增加在區域中之持續性；協乘活性或補助式(I)化合物的活性(例如藉由增加效應的速度或克服斥水性)；或有助於克服或防止對個別成分的抗藥性之發展。特別之額外活性成分將視所欲之組成物的利用性而定。適當除害劑的例子包括下列：

a) 合成除蟲菊精類(pyrethroid)，例如百滅寧(permethrin)、賽滅寧(cypermethrin)、芬化利(fenvalerate)、益化利(esfenvalerate)、第滅寧(deltamethrin)、賽洛寧(cyhalothrin)(特別是 δ -賽洛寧(lambda-cyhalothrin))、畢芬寧(bifenthrin)、芬普寧(fenpropathrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、太氟寧(tefluthrin)、魚安全合成除蟲菊精類(例如埃索芬普(ethofenprox))、天然除蟲菊精(pyrethrin)、治滅寧(tetramethrin)、右亞列寧(s-bioallethrin)、芬福寧(fenfluthrin)、炔丙菊酯(prallethrin)或 5-苯甲基-3-呋喃甲基-(E)-(1R,3S)-2,2-二甲基-3-(2-亞氧硫雜環戊(oxothiolan)-3-基甲基)環丙烷羧酸酯；

b) 有機磷酸鹽類，例如，佈飛松(Profenofos)、蘇佈松(sulprofos)、毆殺松(acephate)、甲基巴拉松(parathion)、谷速松(azinphos-methyl)、滅賜松(demeton-s-methyl)、飛達松(heptenophos)、硫滅松(thiometon)、芬滅松(fenamiphos)、亞素靈(monocrotophos)、佈飛松(profenofos)、三落松(triazophos)、達馬松(methamidophos)、大滅松(dimethoate)、福賜米松(phosphamidon)、馬拉松(malathion)、陶斯松(chlorpyrifos)、裕必松(phosalone)、托福松(terbufos)、繁福松(fensulfothion)、大福松(fonofos)、福瑞松(phorate)、巴賽松(phoxim)、亞特松(pirimiphos-methyl)、必滅松(pirimiphos-ethyl)、撲滅松(fenitrothion)、福賽絕(fosthiazate)或大利松(diazinon)；

c) 胺基甲酸酯類(包括胺基甲酸芳基酯)，例如比加普(pirimicarb)、曲紫美特(triazamate)、克索卡(cloethocarb)、加保扶(carbofuran)、呋線威(furathiocarb)、愛殺芬卡(ethiofencarb)、得滅克(aldicarb)、索福羅斯(thiofurox)、丁基加保扶(carbosulfan)、免敵克(bendiocarb)、丁基滅必蟲(fenobucarb)、安丹(propoxur)、納乃得(methomyl)或毆殺滅(oxamyl)；

d) 苯甲醯脲類，例如二福隆(diflubenzuron)、三福隆(triflumuron)、六伏隆(hexaflumuron)、氟芬隆(flufenoxuron)或克福隆(chlorfluazuron)；

e) 有機錫化合物，例如錫蟪丹(cyhexatin)、芬佈賜(fenbutatin-oxide)或亞環錫(azocyclotin)；

f) 吡啶類，例如替布芬比 (tebufenpyrad) 和 芬普蟎 (fenpyroximate)；

g) 大環內酯類，例如阿凡曼菌素 (avermectin) 或 米貝黴素類 (milbemycins)，例如阿巴汀 (abamectin)、因滅汀 (emamectin benzoate)、伊維菌素 (ivermectin)、米貝黴素 (milbemycin)、賜諾殺 (spinosad) 或 印棟素 (azadirachtin)；

h) 激素類或費洛蒙類；

i) 有機氯化化合物例如安殺番 (endosulfan)、六氯化苯、DDT、克氯丹 (chlordane) 或 地特靈 (dieldrin)；

j) 脘類，例如氯苯甲脘 (chlordimeform) 或 三亞蟎 (amitraz)；

k) 薰煙劑，例如氯化苦 (chloropicrin)、二氯丙烷、溴甲烷或美坦 (metam)；

l) 氯菸鹼基化合物例如益達胺 (imidacloprid)、賽克培 (thiacloprid)、亞滅培 (acetamiprid)、耐特必爛 (nitenpyram) 或 賽速安 (thiamethoxam)；

m) 二醯基脘類，例如得芬諾 (tebufenozide)、環蟲脘 (chromafenozide) 或 甲氧芬立 (methoxyfenozide)；

n) 二苯醚類，例如多芬藍 (diofenolan) 或 派立普斯芬 (pyriproxifen)；

o) 吲哚殺卡 (Indoxacarb)；

p) 克凡派 (Chlorfenapyr)；或

q) 比內秋 (Pyrnetrozine)。

除上列除害劑之主要化學類別之外，其他具有特別目

的之除害劑可使用於組成物中，如果對於所欲之組成物的利用性適當的話。例如，可使用特定作物之選擇性殺蟲劑，例如鑽心蟲(stemborer)特殊殺蟲劑(例如培丹(cartap))或使用於米的飛蟲之特殊殺蟲劑(例如布芬淨(buprofezin))。或者對特定昆蟲的種類／階段具有特異性之殺蟲劑或殺蟎劑也可包含在組成物中(例如殺蟎卵-幼蟲劑，例如，例如克芬蟎(clofentezine)、氟苯米(flubenzimine)、合賽多(hexythiazox)或得脫蟎(tetradifon)；殺蟎 motilicides，例如大克蟎(dicofol)或毆蟎多(propargite)；殺蟎劑，例如新殺蟎(bromopropylate)或克氯苯(chlorobenzilate)；或生長調節劑，例如愛美松(hydramethylnon)、賽滅淨(cyromazine)、甲氧普烯(methoprene)、克福隆(chlorfluazuron)或二福隆(diflubenzuron))。

可包括在本發明組成物之殺真菌化合物的例子為(E)-N-甲基-2-[2-(2,5-二甲基苯氧基甲基)苯基]-2-甲氧基-亞胺基乙醯胺基(SSF-229)、4-溴基-2-氟基-N,N-二甲基-6-三氟甲基苯並咪唑-2-磺醯胺、 α -[N-(3-氟基-2,6-二甲苯基)-2-甲氧基乙醯胺基]- γ -丁內酯、4-氟基-2-氟基-N,N-二甲基-5-對-甲苯基咪唑-2-磺醯胺(IKF-916、斯美達沙米(cyamidazosulfamid))、3-5-二氟基-N-(3-氟基-2-乙基-1-甲基-2-側氧基丙基)-4-甲基苯甲醯胺(RH-7281、佐殺滅(zoxamide))、N-烯丙基-4,5,-二甲基-2-三甲基甲矽烷基噻吩-3-羧醯胺(MON65500)、N-(1-氟基-1,2-二甲基丙基)-2-(2,4-二氟苯氧基)丙醯胺(AC382042)、N-(2-甲氧基-5-吡啶

基)-環丙烷羧醯胺、阿昔貝拉(acibenzolar)(CGA245704)、棉鈴威(alanycarb)、阿地莫非(aldimorph)、敵菌靈(anilazine)、阿扎康唑(azaconazole)、亞托敏(azoxystrobin)、本達樂(benalaxyl)、免賴得(benomyl)、惡霜靈(biloxazol)、比多農(bitertanol)、保米黴素(blasticidin S)、溴克座(bromuconazole)、布瑞莫(bupirimate)、四氯丹(captafol)、蓋普丹(captan)、貝芬替(carbendazim)、貝芬替氫氯酸鹽(chlorhydrate)、萎鏽靈(carboxin)、加普胺(carpropamid)、香芹酮(carvone)、CGA41396、CGA41397、甲基克殺蟎(chinomethionate)、四氯異苯腈(chlorothalonil)、氯諾立那(chlorozolate)、克拉康(clozylacon)、含銅化合物例如氯氧化銅(copper oxychloride)、氧基氫醌銅(copper oxyquinolate)、硫酸銅、樹脂酸銅(copper tallate)和波爾多(Bordeaux)混合物、克絕(cymoxanil)、環克座(cyproconazole)、賽普洛(cyprodinil)、得巴卡(debacarb)、二-2-吡啶基二硫化物 1,1'-二氧化物、益發靈(dichlofluanid)、達滅淨(diclomezine)、大克爛(dicloran)、鮑滅爾(diethofencarb)、待克利(difenoconazole)、燕麥枯(difenzoquat)、二氟林(diiflumerim)、硫代磷酸 O,O'-二-異-丙基-S-苯甲基酯、地美福唑(dimefluazole)、地美康唑(dimetconazole)、達滅芬(dimethomorph)、二甲噻酚(dimethirimol)、達克利(diniconazole)、白粉克(dinocap)、腈硫醌(dithianon)、氯化十二基二甲基銨、十二環嗎啉(dodemorph)、多寧(dodine)、多瓜地(dogvadine)、護粒松

(edifenphos)、依普座(epoxiconazole)、依瑞莫(ethirimol)、
 (Z)-N-苯甲基-N([甲基(甲基-硫亞乙基胺氧羰基)胺基]硫
 基)- β -丙胺酸乙酯、依得利(etridiazole)、凡殺多
 (famoxadone)、芬滅多(fenamidone)(RPA407213)、芬瑞莫
 (fenarimol)、芬克座(fenbuconazole)、芬福瑞(fenfuram)、
 芬海米(fenhexamid)(KBR2738)、芬哌克尼(fenpiclonil)、
 芬撲定(fenpropidin)、芬必莫(fenpropimorph)、三苯醋錫
 (fentin acetate)、三苯羥錫(fentin hydroxide)、富爾邦
 (ferbarn)、噻菌脲(ferimzone)、扶吉胺(fluzinam)、護汰
 寧(fludioxonil)、氟美托(flumetover)、氟美地(fluoroimide)、
 氟喹康唑(fluquinconazole)、護矽得(flusilazole)、福多寧
 (flutolanil)、護汰芬(flutriafol)、福爾培(folpet)、麥穗寧
 (fuberidazole)、福拉斯(furalaxyl)、福拉比(furametpyr)、
 克熱淨(guazatine)、菲克利(hexaconazole)、羥基異噁唑、
 殺紋寧(hymexazole)、依滅列(imazalil)、易胺座
 (imibenconazole)、雙胍辛胺(iminoctadine)、雙胍辛胺三乙
 酸鹽、依康唑(ipconazole)、丙基喜樂松(iprobenfos)、依普
 同(iprodione)、依普瓦立(iprovalicarb)(SZX0722)、異丙基
 丁基胺基甲酸酯、亞賜圃(isoprothiolane)、嘉賜黴素
 (kasugamycin)、克收欣(kresoxim-methyl)、LY186054、
 LY211795、LY248908、鋅錳乃浦(mancozeb)、錳乃浦
 (maneb)、甲霜靈(mefenoxam)、滅派林(mepanipyrin)、滅
 普寧(mepronil)、滅達樂(metalaxyl)、滅克座(metconazole)、
 免得爛(metiram)、免得爛-鋅、苯氧菌胺(metominostrobin)、

邁克尼(myclobutanil)、尼索立(neoasozin)、二甲基二硫代
 胺基甲酸鎳、尼秋沙(nitrothal)-異丙基、尼瑞莫(nuarimol)、
 歐福拉(ofurace)、有機汞化合物、歐殺斯(oxadixyl)、氧殺
 福隆(oxasulfuron)、歐林索酸(oxolinic acid)、歐伯克座
 (oxpoconazole)、嘉保信(oxycarboxin)、披扶座
 (pefurazoate)、平克座(penconazole)、賓克隆(pencycuron)、
 殺枯淨(phenazin oxide)、伏捨替(phosetyl)-Al、磷酸、熱
 必斯(phthalide)、吡可斯賓(picoxystrobin)(ZA1963)、保粒
 黴素(polyoxin) D、代森聯(polyram)、撲殺熱(probenazole)、
 撲克拉(prochloraz)、撲滅寧(procymidone)、普拔克
 (propamocarb)、普克利(propiconazole)、甲基鋅乃浦
 (propineb)、丙酸、白粉松(pyrazophos)、比芬諾(pyrifenox)、
 必滅寧(pyrimethanil)、百快隆(pyroquilon)、彼斯福
 (pyroxyfur)、吡咯尼群(pyrrolnitrin)、四級銨化合物、蟬
 離丹(quinomethionate)、奎諾斯芬(quinoxyfen)、五氯硝苯
 (quintozene)、西克座(sipconazole)(F-155)、五氯酚鈉、螺
 殺胺(spiroxamine)、鏈黴素(streptomycin)、硫、得克利
 (tebuconazole)、克枯爛(tecloftalam)、四氯硝基苯
 (tecnazene)、四克利(tetraconazole)、腐絕(thiabendazole)、
 塞福滅(thifluzamid)、2-(硫氰基甲硫基)苯并噻唑、甲基多
 保淨(thiophanate-methyl)、得恩地(thiram)、替咪苯康唑
 (timibenconazole)、脫克松(tolclofos-methyl)、托福寧
 (tolyfluanid)、三泰芬(triadimefon)、三泰隆(triadimenol)、
 三布替(triazbutil)、三唑氧(triazoxide)、三賽唑

(tricyclazole) 、 三 得 芬 (tridemorph) 、 三 氟 敏 (trifloxystrobin)(CGA279202)、賽福寧(triforine)、賽福座(triflumizole)、環菌唑(triticonazole)、維利黴素A(validamycin A)、衛本(vapam)、免克寧(vinclozolin)、鋅乃浦(zineb)和福美鋅(ziram)。

式(I)之化合物可與用於保護植物以抗種子生、土生或葉真菌疾病的土壤、泥煤或其他的生根介質混合。

該等用於組成物中的適當增效劑之例子包括丁氧化胡椒基、斯沙美(sesamex)、沙福羅沙(safroxan)和十二基咪唑。

包含在組成物中之的適當除草劑和植物-生長調節劑將視所欲的目標及所要效果而定。

可包括在內的米選擇性除草劑的例子為除草靈(propanil)。使用於棉花的植物生長調節劑的例子為PIXTM。

一些混合物可包含具有顯著不同之物理、化學或生物性質致使他們本身不容易適合於相同習用調配物類型之活性成分。在這些環境中，可製備其他的調配物類型。例如，其中一種活性成分為水不溶性固體和另一個為水不溶性液體，然而其可藉由將固體活性成分分散成懸浮液(使用類似於SC之製備的製備)但將液態活性成分分散成乳液(使用類似於EW之製備的製備)而將每種活性成分分散在相同連續水相中。所得組成物為超乳液(SE)調配物。

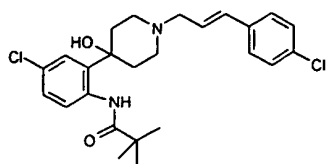
以下列實施例舉例說明本發明：

使用 LCMS：LC5：254 奈米 - 10% A 到 100% B 的梯度 = H₂O + 0.01% HCOOH B = CH₃CN/CH₃OH + 0.01

% HCOOH 正電動噴霧 150-2000 m/z 獲得所選擇的下列實施例化合物之光譜數據。

實施例 1

此實施例舉例說明 N-(4-氯基-2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-4-羥基-哌啶-4-基}-苯基)-2,2-二甲基-丙醯胺的製備



步驟 A：N-(4-氯基-苯基)-2,2-二甲基-丙醯胺的製備

經 30 分鐘期間將 2,2-二甲基-丙醯氯(25.32 克)加到 4-氯苯胺(25.51 克)和三乙胺(69.73 毫升)在氯仿(350 毫升)中的溶液。在 r.t 下攪拌所產生之溶液 1 小時，然後加水且以乙酸乙酯萃取混合物三次。合併之有機層經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮以提供 35.8 克的產物。M.p. 149-150°C；滯留時間 HPLC 2.83 分鐘；MS(ES+) 212(M+H⁺)。

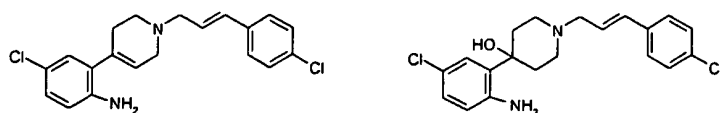
步驟 B：N-(4-氯基-2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-4-羥基-哌啶-4-基}-苯基)-2,2-二甲基-丙醯胺的製備

在 N₂ 大氣下於 -5°C 經 15 分鐘將正-丁基鋰在己烷 47.0 毫升之 1.6M 溶液)中的溶液逐滴加到 N-(4-氯基-苯基)-2,2-二甲基-丙醯胺(6.35 克)在無水 THF(100 毫升)中的溶液。於 0°C 下攪拌所產生之溶液 2 小時，然後於 0°C 下經 1 小時期間將 1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-哌啶-4-酮(7.49 克)在 THF(15 毫升)中的溶液逐滴加到上述二陰離子

的溶液。反應混合物於 0°C 下攪拌 2 小時和然後在 r.t. 下過夜。將溶液倒進冰水內，以濃 HCl 使成酸性且以乙酸乙酯萃取。使水層成鹼性且以乙酸乙酯萃取三次。以水洗滌合併之有機層，經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法(己烷：乙酸乙酯：三乙基胺 49：49：2)以提供標題產物(6.2 克)。M.p. 177-179°C；滯留時間 HPLC 2.19 分鐘；MS(ES+) 461 (M+H⁺)。

實施例 2

此實施例舉例說明 4-氯基-2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-1,2,3,6-四氫基-吡啶-4-基}-苯胺和 4-(2-胺基-5-氯基-苯基)-1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-哌啶-4-醇的製備。

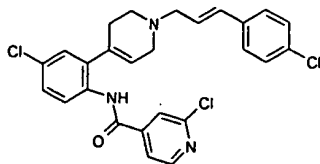


將 N-(4-氯基-2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-4-羥基-哌啶-4-基}-苯基)-2,2-二甲基-丙醯胺(1.00 克)在 3N H₂SO₄(7.5 毫升)和 DMSO(3 毫升)中的懸浮液加熱到回流溫度經 48 小時。然後，加水及以 CH₂Cl₂ 萃取混合物三次，合併之有機層經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法(CH₂Cl₂：MeOH 95：5)以提供 4-氯基-2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-1,2,3,6-四氫基-吡啶-4-基}-苯胺(0.205 克；黏稠油；滯留時間 HPLC 2.15 分鐘；

MS(ES+) 359(M+H⁺)和 4-(2-胺基-5-氯基-苯基)-1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-哌啶-4-醇(0.182 克 ; M.p.168-170°C ; 滯留時間 HPLC 1.95 分鐘 ; MS(ES+) 377(M+H⁺)。

實施例 3

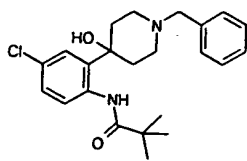
此實施例舉例說明 2-氯基-N-(4-氯基-2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-1,2,3,6-四氫基-吡啶-4-基}-苯基)-異菸鹼醯胺的製備



經 10 分鐘週期將 2-氯基-異菸鹼醯氯(1.5 當量 ; 在 CH₂Cl₂ 中的 0.2M 溶液)加到 4-氯基-2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-1,2,3,6-四氫基-吡啶-4-基}-苯胺(60 毫克)和三乙胺(0.059 毫升)在 CH₂Cl₂(10 毫升)中的溶液。在 r.t.下攪拌所產生之溶液過液，倒進飽和 NaHCO₃ 水溶液內和以 CH₂Cl₂ 萃取混合物三次。合併之有機層經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法(己烷：乙酸乙酯：三乙胺 25 : 73 : 2)以提供標題產物(28 毫克)。黏稠油；滯留時間 HPLC 2.28 分鐘 ; MS(ES+) 500 , 498(M+H⁺)。

實施例 4

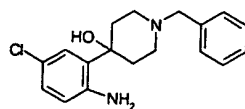
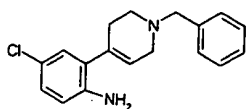
此實施例舉例說明 N-[2-(1-苯甲基-4-羥基-哌啶-4-基)-4-氯基-苯基]-2,2-二甲基-丙醯胺的製備



在 N₂ 大氣下於 -5°C 經 15 分鐘將正-丁基鋰在己烷中的溶液 (22.6 毫升之包含 15% 正-丁基鋰之溶液) 逐滴加到 N-(4-氯基-苯基)-2,2-二甲基-丙醯胺 (3.00 克) 在無水 THF (80 毫升) 中的溶液。於 0°C 下攪拌所產生之溶液 2 小時，然後 1-苯甲基-吡啶-4-酮 (2.67 毫升) 在 THF (20 毫升) 中的溶液於 0°C 下經 1 小時期間逐滴加到上述二陰離子的溶液。反應混合物於 0°C 下攪拌 2 小時和然後在 r.t. 下過夜。然後將溶液倒進冰水內，以濃 HCl 使成酸性且以乙酸乙酯萃取。使水層成鹼性且以乙酸乙酯萃取三次。以水洗滌合併之有機層，經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮。從乙酸乙酯 / THF 再結晶殘餘物以提供標題產物 (2.6 克)。M.p. 252-255°C。

實施例 5

此實施例舉例說明 2-(1-苯甲基-1,2,3,6-四氫基-吡啶-4-基)-4-氯基-苯胺和 4-(2-胺基-5-氯基苯基)-1-苯甲基-吡啶-4-醇的製備。

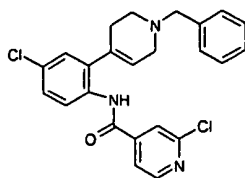


將 N-[2-(1-苯甲基-4-羥基-吡啶-4-基)-4-氯基-苯基]-2,2-二甲基-丙醯胺 (6.00 克) 在 n-BuOH (50 毫升) 中和 6N

HCl(120 毫升)中的懸浮液加熱到回流溫度經 5 天。將溶液倒進冰水內，以濃 HCl 使成酸性且以乙酸乙酯萃取。使水層成鹼性且以 CH_2Cl_2 萃取三次，經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法(己烷：乙酸乙酯：三乙基胺 49：49：2)以提供 2-(1-苯甲基-1,2,3,6-四氫基-吡啶-4-基)-4-氯基-苯胺(2.11 克；黏稠油；滯留時間 HPLC 1.81 分鐘；MS(ES+) 299($\text{M}+\text{H}^+$))和 4-(2-胺基-5-氯基-苯基)-1-苯甲基-吡啶-4-醇(2.11 克；黏稠油；滯留時間 HPLC 1.58 分鐘；MS(ES+) 317($\text{M}+\text{H}^+$)。

實施例 6

此實施例舉例說明 N-[2-(1-苯甲基-1,2,3,6-四氫基-吡啶-4-基)-4-氯基-苯基]-2-氯基-異菸鹼醯胺的製備。

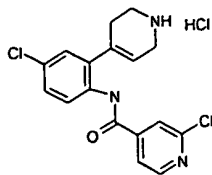


經 10 分鐘週期將 2-氯基-異菸鹼醯氯(1.2 當量；在 CH_2Cl_2 中的 1.0M 溶液)加到 2-(1-苯甲基-1,2,3,6-四氫基-吡啶-4-基)-4-氯基-苯胺(500 毫克)和三乙胺(0.035 毫升)在 CH_2Cl_2 (25 毫升)中的溶液。在 r.t.下攪拌所產生之溶液過液，倒進飽和 NaHCO_3 水溶液內和以 CH_2Cl_2 萃取混合物三次。合併之有機層經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法(己烷：乙酸乙酯：三乙基胺 49：49：2)以提供標題產物(595 毫克)。白色固體；滯留時間 HPLC 1.89

分鐘；MS(ES+) 440，438(M+H⁺)。

實施例 7

此實施例舉例說明 2-氯基-N-[4-氯基-2-(1,2,3,6-四氯基-吡啶-4-基)-苯基]-異菸鹼醯胺鹽酸鹽的製備。



步驟 A：4-{5-氯基-2-[(2-氯基-吡啶-4-羰基)-胺基]苯基}-3,6-二氯基-2H-吡啶-1-羧酸 1-氯基乙酯的製備

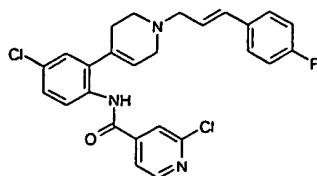
將氯甲酸 1-氯基乙酯(2.64 毫升)加至 N-[2-(1-苯甲基-1,2,3,6-四氯基-吡啶-4-基)-4-氯基-苯基]-2-氯基-異菸鹼醯胺(530 毫克)在甲苯(30 毫升)中的懸浮液。15 分鐘之後，將溶液加熱到回流經 16 小時，然後倒進入飽和 NaHCO₃ 水溶液中和以 CH₂Cl₂ 萃取混合物三次。合併之有機層經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮以提供粗標題產物(550 毫克)。

步驟 B：2-氯基-N-[4-氯基-2-(1,2,3,6-四氯基-吡啶-4-基)-苯基]-異菸鹼醯胺鹽酸鹽的製備。

將粗 4-{5-氯基-2-[(2-氯基-吡啶-4-羰基)-胺基]苯基}-3,6-二氯基-2H-吡啶-1-羧酸 1-氯基乙酯(550 毫克)溶解在甲醇(25 毫升)中和加熱到回流經 16 小時。蒸發以提供粗標題產物(465 毫克)。滯留時間 HPLC 1.48 分鐘；MS(ES+) 350，348(M+H⁺)。

實施例 8

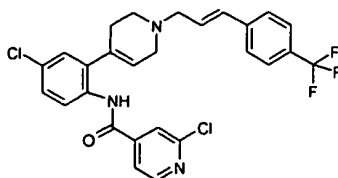
此實施例舉例說明 2-氯基-N-(4-氯基-2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-1,2,3,6-四氫基-吡啶-4-基}-苯基)-異菸鹼醯胺的製備



將粗 4-{5-氯基-2-[(2-氯基-吡啶-4-羰基)-胺基]-苯基}-1-甲基-1,2,3,6-四氫基-吡啶鹽酸鹽(69 毫克；在實施例 7 獲得之產物)溶解在乙腈(5 毫升)中且以 K_2CO_3 (87 毫克)處理。然後加入 1-[(E)-3-氯基-戊烯基]-4-氯基-苯在乙腈(1.0 毫升)中的溶液。在 r.t.下攪拌 3 小時和於 $50^\circ C$ 16 小時和加熱到回流經 16 小時之後將混合物過濾和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法(己烷：乙酸乙酯：三乙基胺 74：24：2)以提供標題產物(51 毫克)。黏稠油；滯留時間 HPLC 2.02 分鐘；MS(ES+) 484, 482(M+H⁺)。

實施例 9

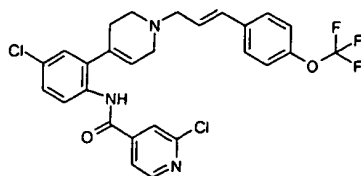
此實施例舉例說明 2-氯基-N-(4-氯基-2-{1-[(E)-3-(4-三氟甲基-苯基)-烯丙基]-1,2,3,6-四氫基-吡啶-4-基}-苯基)-異菸鹼醯胺的製備



將粗 4-{5-氯基-2-[(2-氯基-吡啶-4-羰基)-胺基]-苯基}-1-甲基-1,2,3,6-四氫基-吡啶鹽酸鹽(69 毫克；在實施例 7 獲得之產物)溶解在乙腈(5 毫升)中且以 Hunig 氏鹼(0.068 毫升)處理。然後加入 1-((E)-3-氯基-戊烯基)-4-三氟甲基-苯(53 毫克)在 CHCl_3 (1.0 毫升)中的溶液。在 r.t., 下攪拌 3 小時和於 50°C 16 小時和加熱到回流經 16 小時之後將混合物過濾和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法(己烷：乙酸乙酯：三乙基胺 74:24:2)以提供標題產物(23 毫克)。黏稠油；滯留時間 HPLC 2.02 分鐘；MS(ES+) 534, 532($\text{M}+\text{H}^+$)。

實施例 10

此實施例舉例說明 2-氯基-N-(4-氯基-2-{1-[(E)-3-(4-三氟甲氧基-苯基)-烯丙基]-1,2,3,6-四氫基-吡啶-4-基}-苯基)-異菸鹼鹽胺的製備

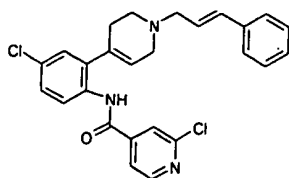


將粗 4-{5-氯基-2-[(2-氯基-吡啶-4-羰基)-胺基]-苯基}-1-甲基-1,2,3,6-四氫基-吡啶鹽酸鹽(69 毫克；在實施例 7

獲得之產物)溶解在乙腈(5 毫升)中且以 Hunig 氏鹼(0.068 毫升)處理。然後加入 1-((E)-3-氯基-戊烯基)-4-三氟甲氧基-苯(56 毫克)在 CHCl_3 (1.0 毫升)中的溶液。在 r.t, 下攪拌 3 小時和於 50°C 經 16 小時和加熱到回流 16 小時之後將混合物過濾和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法(己烷: 乙酸乙酯: 三乙基胺 74: 24: 2)以提供標題產物(46 毫克)。黏稠油; 滯留時間 HPLC 2.33 分鐘; MS(ES+) 550, 548 ($\text{M}+\text{H}^+$)。

實施例 11

此實施例舉例說明 2-氯基-N-{ 4-氯基-2-[1-((E)-3-苯基-烯丙基) 1,2,3,6-四氫基-吡啶-4-基]-苯基}-異菸鹼鹽胺的製備

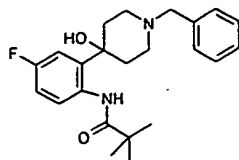


將粗 4-{5-氯基-2-[(2-氯基-吡啶-4-羰基)-胺基]-苯基}-1-甲基-1,2,3,6-四氫基-吡啶鹽酸鹽(69 毫克; 在實施例 7 獲得之產物)溶解在乙腈(5 毫升)中且以 Hunig 氏鹼(0.068 毫升)處理。然後加入((E)-3-氯基-戊烯基)-苯(53 毫克)在 CHCl_3 (1.0 毫升)中的溶液。在 r.t, 下攪拌 3 小時和於 50°C 16 小時和加熱到回流經 16 小時之後將混合物過濾和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法(己烷: 乙酸乙酯: 三乙基胺 74: 24: 2)以提供標題產物(36 毫克)。黏稠油; 滯留

時間 HPLC 2.01 分鐘；MS(ES+) 466, 464 (M+H⁺)。

實施例 12

此實施例舉例說明 N-[2-(1-苯甲基-4-羥基-哌啶-4-基)-4-氟基-苯基]-2,2-二甲基-丙醯胺的製備



步驟 A：N-(4-氟基-苯基)-2,2-二甲基-丙醯胺的製備

經 30 分鐘期間將 2,2-二甲基-丙醯氯(58.0 毫升)加到 C4-氟苯胺(50.0 克)和三乙胺(157 毫升)在 H₂Cl₂(700 毫升)中的溶液。所產生之溶液在 r.t.下攪拌 2 小時，然後加水且以乙酸乙酯萃取混合物三次。合併之有機層經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮以提供 86.0 克的標題化合物。M.p. 124-125 °C；滯留時間 HPLC 2.57 分鐘；MS(ES+) 196(M+H⁺)。

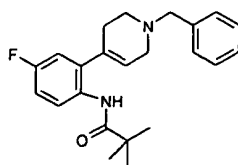
步驟 B：N-(4-氟基-2-{1-[(E)-3-(4-氟基-苯基)-烯丙基]-4-羥基-哌啶-4-基}-苯基)-2,2-二甲基-丙醯胺的製備

在 N₂ 大氣下於 -5°C 經 15 分鐘將正-丁基鋰在己烷(80.0 毫升之 1.6M 溶液)中的溶液逐滴加到 N-(4-氟基-苯基)-2,2-二甲基-丙醯胺(10.0 克)在無水 THF(200 毫升)中的溶液。於 0°C 下攪拌所產生之溶液 2 小時，然後於 0°C 下經 1 小時期間將 1-苯甲基-哌啶-4-酮(9.20 毫升)在 THF(20 毫升)中的溶液逐滴加到上述二陰離子的溶液。反應混合物於 0

°C 下攪拌 2 小時和然後在 r.t. 下過夜。將溶液倒進冰水內，以濃 HCl 使成酸性且以乙酸乙酯萃取。使水層成鹼性且以乙酸乙酯萃取三次。以水洗滌合併之有機層，經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法(己烷：乙酸乙酯：三乙基胺 49：49：2)以提供標題產物(8.3 克)。M.p. 172-173 °C；滯留時間 HPLC 1.47 分鐘；MS(ES+) 385(M+H⁺)。

實施例 13

此實施例舉例說明 N-[2-(1-苯甲基-1,2,3,6-四氫基-吡啶-4-基)-4-氟基-苯基]-2,2-二甲基-丙醯胺的製備

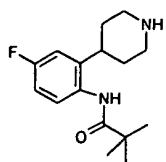


將 N-(4-氟基-2-{1-[(E)-3-(4-氟基-苯基)-烯丙基]-4-羥基-吡啶-4-基}-苯基)-2,2-二甲基-丙醯胺(4.00 克)在濃 HCl(2.4 毫升)和濃 AcOH(30 毫升)中的溶液加熱到回流溫度經 24 小時。然後，加水及以 CH₂Cl₂ 萃取混合物三次，合併之有機層經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮。殘餘物溶解在 CH₂Cl₂(30 毫升)中且以三乙胺(2.8 毫升)和 2,2-二甲基-丙醯氯(0.61 毫升)處理。在 r.t. 下攪拌所產生之溶液 2 小時，然後加水及以乙酸乙酯萃取混合物三次。合併之有機層經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法(己烷：乙酸乙酯：三乙基胺 79：19：2)以提供標題

產物 (3.1 克)。黏稠油；滯留時間 HPLC 2.00 分鐘；MS(ES+) 367(M+H⁺)。

實施例 14

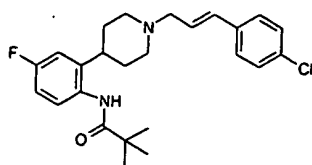
此實施例舉例說明 N-(4-氟基-2-哌啶-4-基-苯基)-2,2-二甲基-丙醯胺的製備



N-[2-(1-苯甲基-1,2,3,6-四氫基-吡啶-4-基)-4-氟基-苯基]-2,2-二甲基-丙醯胺 (500 毫克) 和 10% Pd-C (50 毫克) 在 EtOH (50 毫升) 中的懸浮液在 H₂ 大氣下攪拌 16 小時。然後，過濾混合物和在真空中濃縮所產生之溶液以提供標題化合物 (380 毫克)。黏的油；滯留時間 HPLC 1.61 分鐘；MS(ES+) 279(M+H⁺)。

實施例 15

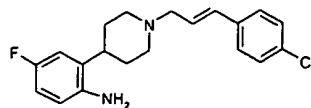
此實施例舉例說明 N-(2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-哌啶-4-基}-4-氟基-苯基)-2,2-二甲基-丙醯胺的製備



將 N-(4-氟基-2-哌啶-4-基-苯基)-2,2-二甲基-丙醯胺 (380 毫克) 溶解在 CHCl_3 (20 毫升) 中且以三乙基胺 (0.260 毫克) 處理。然後，加入 1-((E)-3-氯基-戊烯基-4-氯基-苯 (255 毫克) 的溶液。在 r.t. 下攪拌 16 小時之後，過濾混合物和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法 (己烷：乙酸乙酯：三乙基胺 74：24：2) 以提供標題產物 (380 毫克)。M.p. 174-176 °C；滯留時間 HPLC 2.37 分鐘；MS(ES+) 4.29(M+H⁺)。

實施例 16

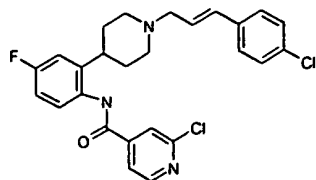
此實施例舉例說明 2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-哌啶-4-基}-4-氯基-苯胺的製備



將 N-(2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-哌啶-4-基}-4-氯基-苯基)-2,2-二甲基-丙醯胺 (315 毫克) 在 6N HCl (25 毫升) 和濃 AcOH (25 毫升) 中的溶液加熱到回流溫度經 20 小時。然後，藉由加入固體 NaOH 使溶液成鹼性 (pH = 12)，且以 CH_2Cl_2 萃取三次。合併之有機層經硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法 (己烷：乙酸乙酯：三乙基胺 79：19：2) 以提供標題產物 (201 毫克)。M.p. 93-94 °C；滯留時間 HPLC 2.18 分鐘；MS(ES+) 345(M+H⁺)。

實施例 17

此實施例舉例說明 2-氯基-N-(2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-哌啶-4-基}-4-氯基-苯基)-異菸鹼醯胺的製備

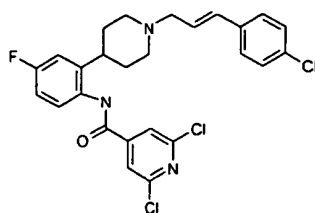


經 10 分鐘週期將 2-氯基-異菸鹼醯氯(1.2 當量；在 CH_2Cl_2 中的 1.0M 溶液)加到 2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-哌啶-4-基}-4-氯基-苯胺(40 毫克)和三乙胺(0.025 毫升)在 CH_2Cl_2 (10 毫升)中的溶液。在 r.t.下攪拌所產生之溶液，倒進飽和 NaHCO_3 水溶液內和以 CH_2Cl_2 萃取混合物三次。合併之有機層經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法(乙酸乙酯：甲醇 9：1)以提供標題產物(43 毫克)。白色固體；滯留時間 HPLC 2.36 分鐘；MS(ES+) 486, 484($\text{M}+\text{H}^+$)。

根據此方法從 2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-哌啶-4-基}-4-氯基-苯胺開始製備下列化合物：

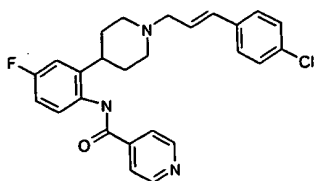
- 2,6-二氯基-N-(2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-哌啶-4-基}-4-氯基-苯基)-異菸鹼醯胺

白色固體；滯留時間 HPLC 2.67 分鐘；MS(ES+) 520, 518($\text{M}+\text{H}^+$)。



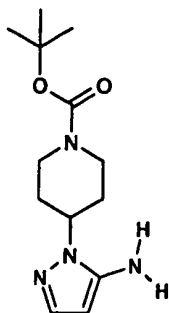
• N-(2-{1-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-哌啶-4-基}-4-氯基-苯基)-異菸鹼醯胺

白色固體；滯留時間 HPLC 2.07 分鐘；MS(ES+) 450(M+H⁺)。



實施例 18

此實施例舉例說明 4-(5-氨基-吡唑-1-基)-哌啶-1-羧酸三級-丁酯的製備

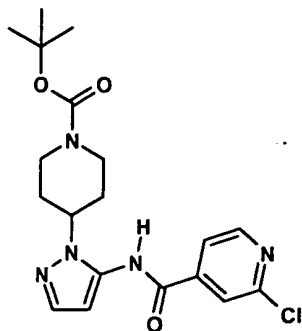


在室溫下將 2-氯乙基胼(5.1 克)在絕對乙醇(20 毫升)中的溶液逐滴加到 N-BOC-哌啶酮(12 克)在絕對乙醇中的溶液。在室溫下攪拌所產生之溶液 1 小時然後在真空中除去溶劑。然後將所產生之油加至丁醇鈉(從 2.8 克鈉和 60 毫升之正-丁醇製備)的溶液和將反應混合物回流 3 小時，冷卻到室溫，以飽和氯化銨水溶液然後與水洗滌，和在真空中除去溶劑。從己烷的沈澱作用提供標題化合物的黃色粉末(11.5 克)。M.p. 145-147°C；¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.5

(s, 9H), 1.9 (m, 2H), 2.1 (m, 2H), 2.9 (m, 2H), 3.5 (m, 2H), 4.0 (m, 1H), 4.2 (m, 2H), 5.5 (s, 1H), 7.3 (s, 1H)。

實施例 19

此實施例舉例說明 4-{ 5-[(2-氯基-吡啶-4-羰基)-胺基]-吡唑-1-基}-哌啶-1-羧酸三級-丁酯的製備



將三乙胺(2.8 毫升)加至實施例 18 中所獲得之化合物(2.66 克)在二氯甲烷(100 毫升)中的攪拌溶液；將溶液冷卻到 0°C 和加入 2-氯異菸鹼醯氯(從 2.05 克的 2-氯異菸鹼酸和 1.46 毫升草醯氯在 50 毫升二氯甲烷中製備)。在室溫下攪拌所產生之混合物 12 小時，倒進水內，以二氯甲烷萃取二次；合併之有機層經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮。

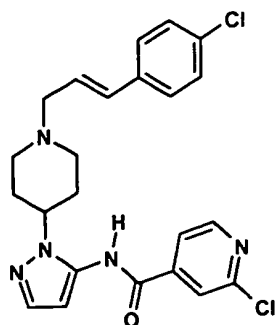
殘餘物從乙酸乙酯／己烷沈澱以提供標題化合物的淡黃色粉末(3.4 克)。M.p. 209-210°C；¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.5 (s, 9H), 1.9 (m, 2H), 2.1 (m, 2H), 2.9 (m, 2H), 3.5 (m, 2H), 4.0 (m, 1H), 4.2 (m, 2H), 6.1 (s, 1H), 7.5 (s, 1H), 7.6 (m, 1H), 7.7 (s, 1H), 8.2 (sm, 1H), 8.5 (d, J = 6 Hz, 1H)。

實施例 20

此實施例舉例說明 2-氯基 N-(2-{1-[3-(4-氯基-苯基)-

(S)

烯丙基]-哌啶-4-基}-2H-吡唑-3-基)-異菸鹼鹽胺的製備

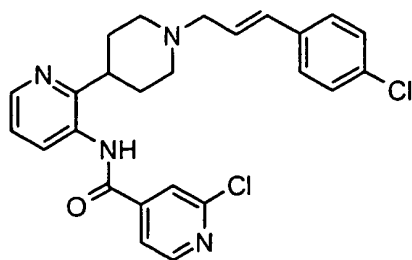


實施例 19 中所獲得之化合物(2.7 克)在二氯甲烷(150 毫升)中的溶液在室溫下以三氟乙酸(3.8 毫升)處理 6 小時的和在真空中除去溶劑。將殘餘物溶解在乙腈(100 毫升)中，加入 N,N-二異丙基乙胺(9 毫升)和 4-氯苯烯丙基氯(1.9 克)。在室溫下攪拌所產生之溶液 24 小時，在真空中除去溶劑及殘餘物進行矽凝膠層析法(乙酸乙酯：甲醇 95：5)以提供鑑定為 2-{1-[3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-哌啶-4-基}-2H-吡唑-3-基胺之產物。此產物根據步驟 B 中所述之方法使用 1.05 克的 2-氯異菸鹼鹽氯、0.7 毫升三乙胺在 50 毫升二氯甲烷中再鹽化。殘餘物的矽凝膠層析法(乙酸乙酯：甲醇 95：5)最後提供標題產物(370 毫克)。M.p. 69-70°C。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.9- 2.4 (m, 6H), 3.0 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 3.1 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 3.9 (m, 1H), 6.2 (m, 2H), 6.5 (d, J = 16.0 Hz, 1H), 7.3 (m, 4H), 7.5 (s, 1H), 7.6 (s, 1H), 7.7 (br s, 1H), 8.6 (d, J = 4.8 Hz, 1H)。滯留時間 HPLC 2.32 分鐘；MS (ES+) 456/458 (M+H⁺)。

本發明進一步以下列採用文叉偶合反應的實施例舉例說明。

實施例 21

此實施例舉例說明 2-氯基-N-{1'-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-1',2',3',4',5',6'-六氫基-[2,4']聯吡啶基-3-基}-異菸鹼鹽胺的製備。



步驟 A：在乾燥之氮沖洗燒瓶中將 1-(三級-丁氧羰基)-4-三丁基甲錫烷基-1,2,3,6-四氫吡啶(2.12 克，根據 WO 0123381 以 2 個步驟從 1-(三級-丁氧羰基)-哌啶-4-酮製備)溶解在甲苯(45 毫升)中。加入 2-氯基-3-硝基吡啶(712 毫克)和肆(三苯基膦)鈀(130 毫克)且於 110°C 下加熱溶液 16 小時。將反應混合物冷卻到室溫，在真中除去溶劑和將殘餘物分溶在乙酸乙酯(100 毫升)和 NaOH 2N(100 毫升)之間。在室溫下攪拌 30 分鐘之後，分開有機層，以 NaOH 2N 然後水洗滌，經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法(乙酸乙酯：環己烷 3:7)以提供 3-硝基-3',6'-二氫基-2'H-[2,4']聯吡啶基-1'-羧酸三級-丁基(1.1 克)之淡黃色結晶。M.p. 104-105°C；¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.4 (s, 9H), 2.5 (m, 2H), 3.6 (m, 2H), 4.0 (m, 2H), 5.9 (m, 1H), 7.3 (dd, J = 4.8, 8.4 Hz, 1H), 8.0 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 8.7 (d, J = 4.8 Hz, 1H)；MS (ES+) 206 (MH⁺-BOC)，

248 (MH^+ -異戊烯)。

步驟 B：將聯胺單水合物(0.4 毫升)加至雷內鎳(在水中的 50% 漿液，200 毫克)及在步驟 A 中所獲得之產物(240 毫克)在乙醇(10 毫升)的懸浮液。在攪拌 4 小時之後，經過 Hyflo 過濾反應混合物且在真空中除去溶劑。將殘餘物溶解在乙酸乙酯中，經過硫酸鈉乾燥，過濾和在真空中濃縮以提供 3-胺基-3',6'-二氫基-2'H-[2,4']聯吡啶基-1'-羧酸三級-丁酯的白色結晶(200 毫克)。M.p. 104-105°C； ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 1.4 (s, 9H), 2.5 (m, 2H), 3.6 (m, 2H), 3.7 (brs, 2H), 4.0 (m, 2H), 5.9 (m, 1H), 6.9 (m, 2H), 8.0 (m, 1H)；MS (ES+) 176 (MH^+ -BOC), 220 (MH^+ -異戊烯), 276 (MH^+)。

步驟 C：在步驟 B 中所獲得之產物(815 毫克)藉由使用 10% Pd/C(200 毫克)和甲酸銨(935 毫克)在乙醇(40 毫升)之轉移氫化作用在 60°C 下還原 45 分鐘。經過 Hyflo 過濾之後，在真空中除去溶劑。將殘餘物分溶在乙酸乙酯和水之間，分開有機層，以水洗滌，經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮以產生 3-胺基-3',4',5',6'-二氫基-2'H-[2,4']聯吡啶基-1'-羧酸三級-丁酯(785 毫克)。 ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 1.4 (s, 9H), 1.6 (m, 4H), 2.7 (m, 3H), 3.5 (brs, 2H), 4.0 (m, 2H), 6.9 (m, 2H), 8.0 (m, 1H)；MS (ES+) 178 (MH^+ -BOC), 222 (MH^+ -異戊烯), 278 (MH^+)。

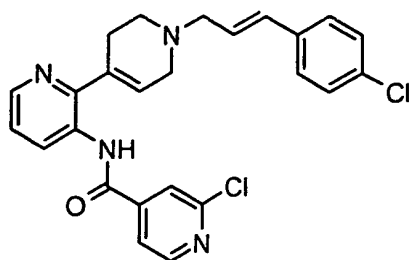
步驟 D：將碳酸氫鈉(714 毫克)加至在步驟 C 中獲得之化合物(785 毫克)在二氯甲烷(30 毫升)中的攪拌溶液；然

後以 2-氯基-異菸鹼鹽氣(500 毫克)處理溶液及在室溫下攪拌所產生之混合物 1 小時，倒進水內，以二氯甲烷萃取二次，合併之有機層經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮以提供 3-[(2-氯基-吡啶-4-羰基)-胺基]-3',4',5',6'-四氫基-2'H-[2,4']聯吡啶基-1'-羧酸三級-丁酯(1.2 克)。

步驟 E：在室溫下以三氯乙酸(4 毫升)處理步驟 D 中所獲得之化合物(834 毫克)在二氯甲烷(40 毫升)中的溶液 5 小時。是在真空中濃縮反應混合物和然後在高真空下乾燥 1 小時。殘餘物溶解在乙(40 毫升)中，加入二異丙基乙胺(1.8 毫升)和 4-氯苯烯丙基氯(380 毫克)。在室溫下攪拌溶液 20 小時，在真空中除去溶劑及殘餘物進行矽凝膠層析法(乙酸乙酯：甲醇 95：5)以提供標題產物的黃色固體(409 毫克)。M.p. 78-80°C；¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.9 (m, 2H), 2.2 (m, 4H), 2.8 (m, 1H), 3.2 (d, J = 9 Hz, 2H), 3.3 (m, 2H), 6.2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.1-7.3 (m, 5H), 7.6 (d, J = 4.4 Hz, 1H), 7.7 (s, 1H), 7.9 (m, 1H, NH), 8.0 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 8.6 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 8.7 (d, J = 5.5 Hz, 1H)；滯留時間 HPLC 1.53 分鐘；MS (ES+) 467/469 (M+H⁺)。

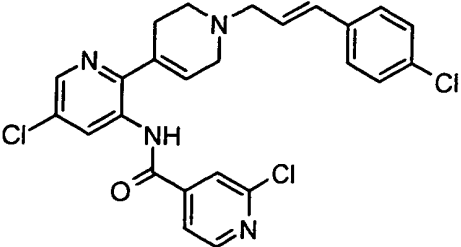
實施例 22

此實施例舉例說明 2-氯基-N-{1'-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-1',2',3',6'-六氫基-[2,4']聯吡啶-3-基}-異菸鹼鹽胺的製備。



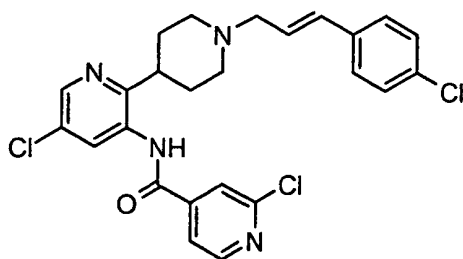
如實施例 1 步驟 D 和 E 所述處理 3-胺基-3',6'-二氫基-2'H-[2,4']聯吡啶-1'-羧酸三級-丁酯(實施例 1, 步驟 B, 205 毫克)以提供標題產物的黃色固體(182 毫克)。75-77°C ; ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) 1.8 (m, 2H), 2.7 (m, 2H), 2.8 (m, 2H), 3.2 (m, 2H), 3.3 (m, 2H), 6.0 (s, 1H), 6.2 (dt, $J = 18, 9$ Hz, 1H), 6.5 (d, $J = 18$ Hz, 1H), 7.1-7.3 (m, 6H), 7.6 (m, 1H), 7.7 (s, 1H), 7.7 (s, 1H), 8.3 (d, $J = 3.6$ Hz, 1H), 8.5 (d, $J = 5.5$ Hz, 1H), 8.8 (m, 1H, NH); 滯留時間 HPLC 1.51 分鐘; MS(ES+) 465/467($\text{M}+\text{H}^+$)。

下列化合物係根據類似於實施例 22 中所述之步驟製備：

化合物名稱	結構	M.p (°C)	MH ⁺	滯留時間 (分鐘)
2-氯基-N-(1'-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-1',2',3',6'-六氫基-[2,4']聯吡啶基-3-基)-異菸鹼醯胺			499/501/503	1.64

實施例 23

此實施例舉例說明 2-氯基-N-{5-氯基-1'-[(E)-3-(4-氯基-苯基)-烯丙基]-1',2',3',4',5',6'-六氫基-[2,4']聯吡啶-3-基}-異菸鹼醯胺的製備。



三甲基氯甲矽烷和 1,2-二溴乙烷之混合物(7:5 v/v, 0.125 毫升)逐滴加到鋅粉(422 毫克)在二甲基乙醯胺(3 毫升)中的懸浮液(將 T°C 保持在 50°C 以下)。在室溫下攪拌混合物 20 分鐘,然後經 5 分鐘逐滴加入 1-(三級-丁氧羰基)-4-碘基-哌啶(1.62 克,根據 J. Org. Chem. 2004, 5120 以 2 個步驟從 1-(三級-丁氧羰基)-哌啶-4-酮製備)在二甲基乙醯胺(3 毫升)中的溶液(些微地放熱)。在室溫下攪拌所產生之混合物 30 分鐘然後套管加入 2,5-二氯基-3-胺基密啶(603 毫克)、碘化銅(I)(42 毫克)和 PdCl₂(91 毫克)在二甲基乙醯

胺(5 毫升)中的混合物。於 80°C 下攪拌所產生之混合物 3 小時，冷卻到室溫，倒進水內，以乙酸乙酯萃取，經過硫酸鈉乾燥和在真空中濃縮。殘餘物進行矽凝膠層析法(乙酸乙酯：環己烷 3：7)以提供 3-胺基-5-氯基-3',6'-二氫基-2'H-[2,4']聯吡啶基-1'-羧酸三級-丁酯之黃色固體(535 毫克)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.4 (s, 9H), 1.8 (m, 4H), 2.6 (m, 1H), 2.8 (m, 2H), 3.7 (br s, 2H), 4.2 (m, 2H), 6.9(s, 1H), 7.9(s, 1H)。如此獲得的產物(448 毫克)如實施例 1 步驟 D 和 E 所述處理以提供標題產物的白色固體(455 毫克)。M.p. 63-67°C ; ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.9 (m, 2H), 2.2 (m, 4H), 2.7 (m, 1H), 3.2 (m, 2H), 3.3 (m, 2H), 6.2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6.5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7.1-7.3 (m, 4H), 7.7 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 7.8 (s, 1H), 7.9 (m, 1H, NH), 8.3 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.4 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 8.6 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 8.7 (d, J = 5.5 Hz, 1H); 滯留時間 HPLC 1.53 分鐘; MS (ES+) 501/503/505 (M+H⁺)。

下列化合物係根據類似於實施例 23 所述的步驟製備：

化合物名稱	結構	M.p (°C)	MH ⁺	滯留時間 (分鐘)
2-氯基-N-(4-氯基-1'- -[(E)-3-(4-氯基-苯基)- 烯丙基]1',2',3',5',6'- -六氫基-[2,4']聯吡 -啉基-3-基}-異菸 -鹼鹽胺		80-85	499/501/503	1.55
N-(5-溴基-3-{1-[(E)- -3-(4-氯基-苯基)-烯 丙基]-吡啶基-4-基} -吡啶-2-基-氯基-異 菸鹼鹽胺			548/550	1.33

下列化合物(表 S1-S11)係如流程 8-13 所述應用 Suzuki 交叉偶合反應製備。採用描述於文獻[例如 P.R Eastwood, THL 41, 3705 (2000)]中或如上所述之反應條件。

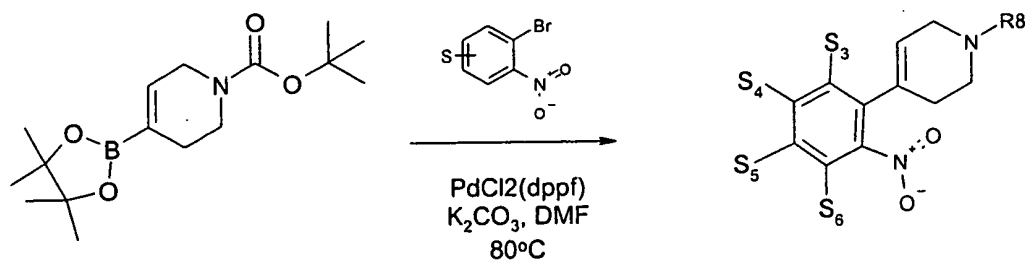


表 S1

化合物編號	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	Mp (°C)	MH ⁺ -BOC	滯留時間 (分鐘)
S-1-1	BOC	H	H	CH ₃	H		219/220	2.28
S-1-2	BOC	H	H	F	H		323/322	2.22
S-1-3	BOC	H	H	CF ₃	H		373/372	2.30
S-1-4	BOC	H	H	OCH ₃	H		235/234	2.23
S-1-5	BOC	CH ₃	H	H	H		219/220	2.19
S-1-6	BOC	H	H	H	CH ₃	100-102	219/220	2.22
S-1-7	BOC	H	H	COOCH ₃	H		263/264	2.08

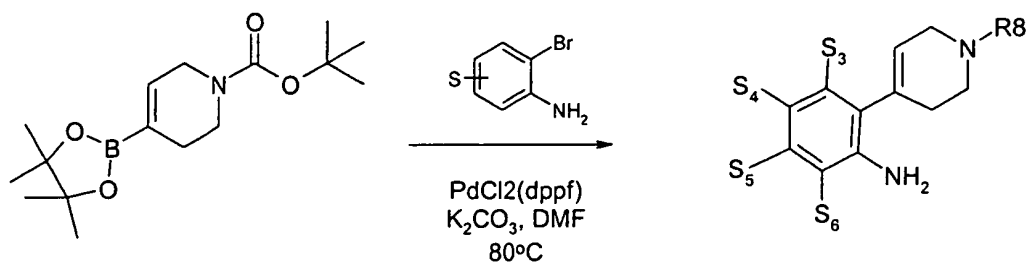


表 S2

化合物編號	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	Mp (°C)	MH ⁺ -BOC	滯留時間 (分鐘)
S-2-1	BOC	H	H	H	F	100-102	19/3194	2.15
S-2-2	BOC	H	F	H	F		211/210	2.12
S-2-3	BOC	H	i-Pr	H	H		217/216	2.11
S-2-4	BOC	H	F	F	F		229/230	2.21
S-2-5	BOC	H	OCF ₃	H	H		259/260	2.22
S-2-6	BOC	H	H	H	H		193/194	2.02

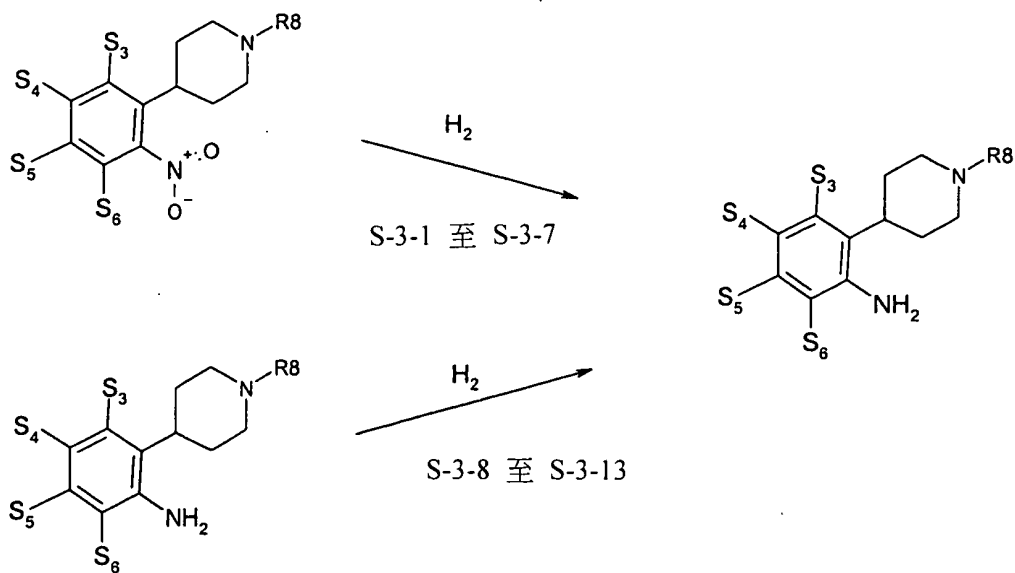


表 S3

化合物編號	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	Mp (°C)	MH ⁺ -BOC	滯留時間 (分鐘)
S-3-1	BOC	H	H	CH ₃	H		191/192	1.90
S-3-2	BOC	H	H	F	H		195/196	2.05
S-3-3	BOC	H	H	CF ₃	H		245/246	2.22
S-3-4	BOC	H	H	OCH ₃	H		207/208	1.92
S-3-5	BOC	CH ₃	H	H	H		191/192	1.87
S-3-6	BOC	H	H	H	CH ₃		191/192	2.06
S-3-7	BOC	H	H	COOCH ₃	H		235/236	2.00
S-3-8	BOC	H	H	H	F	123-126	195/196	2.12
S-3-9	BOC	H	F	H	F		213/214	2.10
S-3-10	BOC	H	i-Pr	H	H		219/220	2.00
S-3-11	BOC	H	F	F	F		231/232	2.16
S-3-12	BOC	H	OCF ₃	H	H		261/262	2.18
S-3-13	BOC	H	F	H	H		195/196	1.87

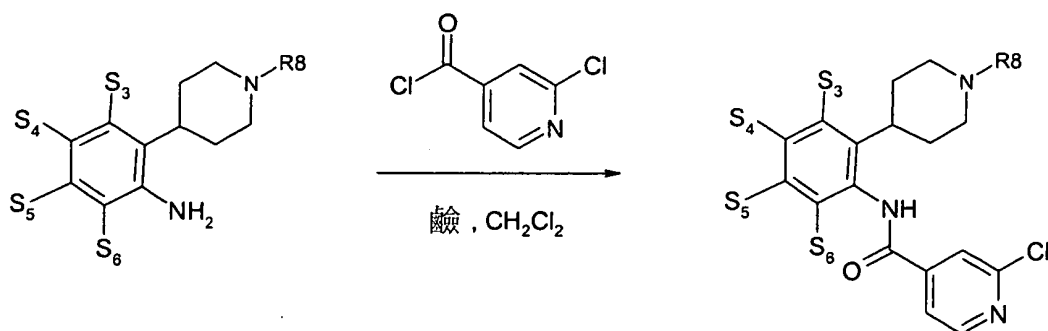


表 4

化合物編號	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	Mp (°C)	MH ⁺ -BOC	滯留時間 (分鐘)
S-4-1	BOC	H	H	CH ₃	H	非晶形	330/332/333	2.14
S-4-2	BOC	H	H	F	H	非晶形	334/336/337	2.11
S-4-3	BOC	H	H	CF ₃	H	非晶形	384/386/387	2.22
S-4-4	BOC	H	H	OCH ₃	H	非晶形	346/348/349	2.07
S-4-5	BOC	CH ₃	H	H	H	非晶形	330/332/333	2.04
S-4-6	BOC	H	H	H	CH ₃		330/332/333	2.06
S-4-7	BOC	H	H	COOCH ₃	H	非晶形	374/376/377	2.05
S-4-8	BOC	H	H	H	F	非晶形	334/336/337	2.02
S-4-9	BOC	H	F	H	F	非晶形	352/354/355	2.08
S-4-10	BOC	H	i-Pr	H	H	非晶形	358/360/261	2.25
S-4-11	BOC	H	F	F	F	非晶形	370/372/372	2.25
S-4-12	BOC	H	OCF ₃	H	H	227-230	400/402/403	2.22

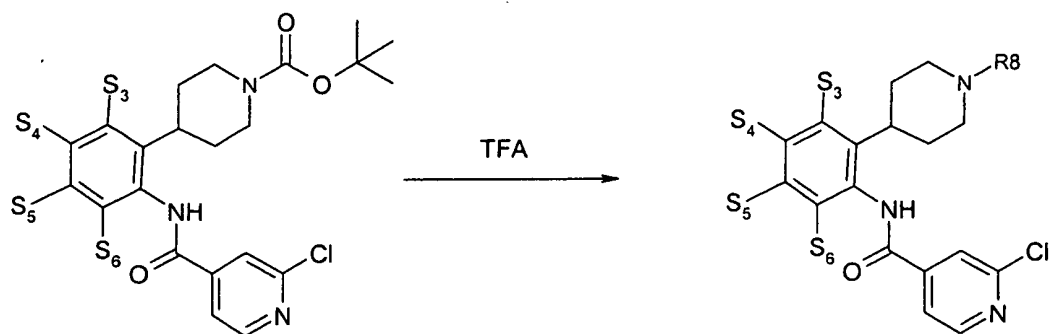


表 S5

化合物編號	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	Mp (°C)	MH ⁺ -BOC	滯留時間 (分鐘)
S-5-1	H	H	H	CH ₃	H	非晶形	330/332/333	1.17
S-5-2	H	H	H	F	H	非晶形	334/336/337	1.18
S-5-3	H	H	H	CF ₃	H	非晶形	384/386/387	1.35
S-5-4	H	H	H	OCH ₃	H	非晶形	346/348/349	1.17
S-5-5	H	CH ₃	H	H	H	非晶形	330/332/333	1.12
S-5-6	H	H	H	H	CH ₃	非晶形	330/332/333	1.15
S-5-7	H	H	H	COOCH ₃	H	非晶形	374/376/377	1.13
S-5-8	H	H	H	H	F	非晶形	334/336/337	1.14
S-5-9	H	H	F	H	F	非晶形	352/354/355	1.22
S-5-10	H	H	i-Pr	H	H	非晶形	358/360/361	1.37
S-5-11	H	H	F	F	F	非晶形	370/372/372	1.28
S-5-12	H	H	OCF ₃	H	H	非晶形	400/402/403	1.30

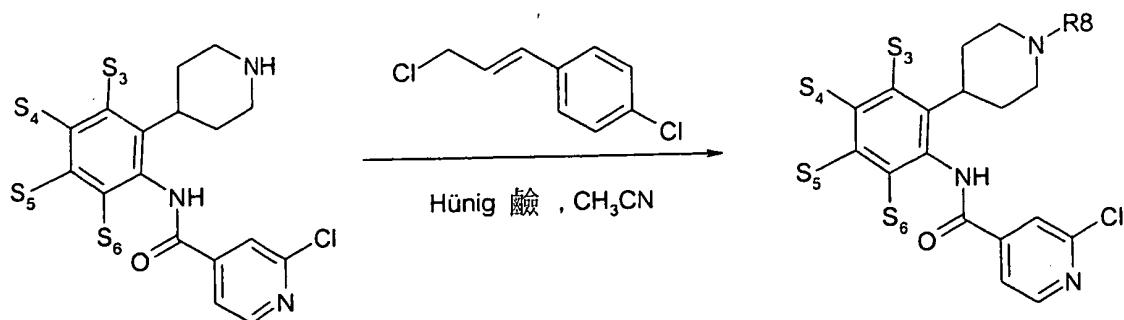


表 S6

化合物編號	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	Mp (°C)	MH ⁺ -BOC	滯留時間 (分鐘)
S-6-1	4-氯苯烯丙基	H	H	CH ₃	H	230-206	480/482/483	1.51
S-6-2	4-氯苯烯丙基	H	H	F	H		484/486/487	1.49
S-6-3	4-氯苯烯丙基	H	H	CF ₃	H		534/536/537	1.59
S-6-4	4-氯苯烯丙基	H	H	OCH ₃	H		496/498/499	1.47
S-6-5	4-氯苯烯丙基	CH ₃	H	H	H	非晶形	480/482/483	1.49
S-6-6	4-氯苯烯丙基	H	H	H	CH ₃	90-93	480/482/483	1.54
S-6-7	4-氯苯烯丙基	H	H	COOCH ₃	H	92-95	524/526/527	1.52
S-6-8	4-氯苯烯丙基	H	H	H	F		484/486/487	1.44
S-6-9	4-氯苯烯丙基	H	F	H	F	221-223	502/504/505	1.49
S-6-10	4-氯苯烯丙基	H	i-Pr	H	H	非晶形	508/510/511	1.61
S-6-11	4-氯苯烯丙基	H	F	F	F	非晶形	520/522/523	1.53
S-6-12	4-氯苯烯丙基	H	OCF ₃	H	H		550/552/553	1.61
S-6-13	4-氯苯烯丙基	H	F	H	H	165-167	484/486/487	1.49

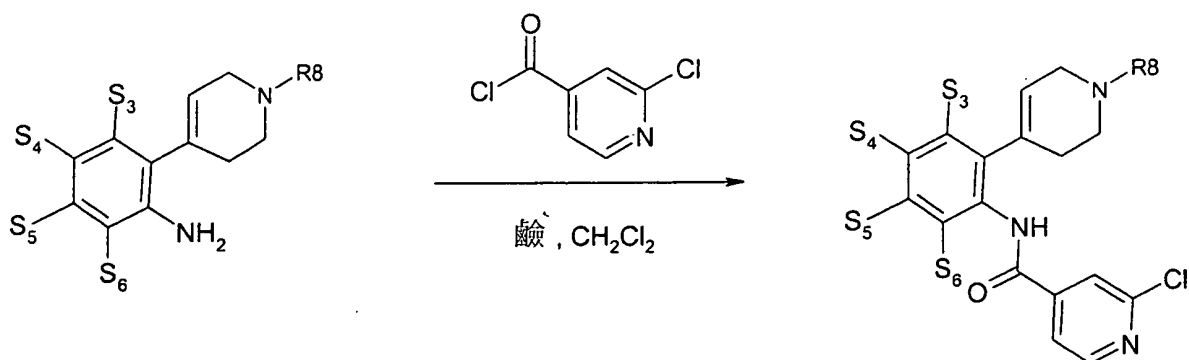


表 7

化合物編號	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	Mp (°C)	MH ⁺ -BOC	滯留時間 (分鐘)
S-7-1	BOC	H	F	H	F	非晶形	350/352/353	2.07
S-7-2	BOC	H	i-Pr	H	H	167-169	356/358/359	2.27
S-7-3	BOC	H	F	F	F	169-171	368/370/371	2.13
S-7-4	BOC	H	OCF ₃	H	H	非晶形	398/400/401	2.23
S-7-5	BOC	H	F	H	H	非晶形	332/334/335	2.12

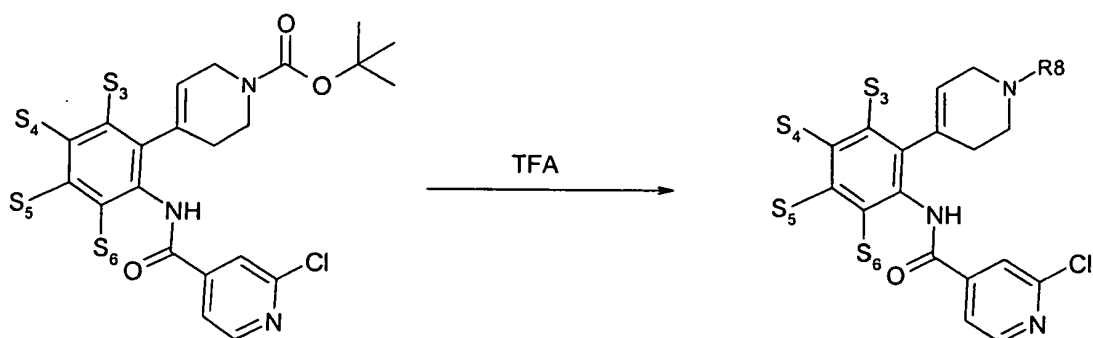


表 8

化合物編號	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	Mp (°C)	MH ⁺	滯留時間 (分鐘)
S-8-1	H	H	F	H	F			
S-8-2	H	H	i-Pr	H	H	非晶形	356/358/359	1.33
S-8-3	H	H	F	F	F			
S-8-4	H	H	OCF ₃	H	H	非晶形	398/400/401	1.37
S-8-5	H	H	F	H	H	非晶形	332/334/335	1.09

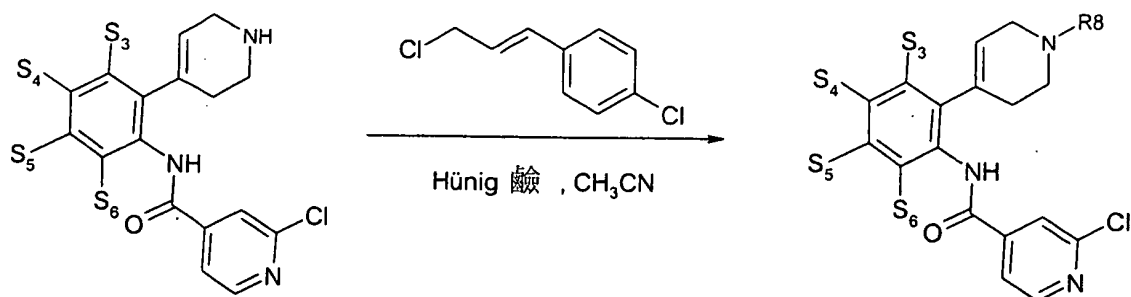


表 9

化合物編號	R ⁸	S ₃	S ₄	S ₅	S ₆	Mp (°C)	MH ⁺	滯留時間 (分鐘)
S-9-1	4-氯苯烯丙基	H	F	H	F			
S-9-2	4-氯苯烯丙基	H	i-Pr	H	H	非晶形	506/508/509	1.67
S-9-3	4-氯苯烯丙基	H	F	F	F			
S-9-4	4-氯苯烯丙基	H	OCF ₃	H	H		548/550/551	1.66
S-9-5	4-氯苯烯丙基	H	F	H	H	非晶形	482/484/485	1.47

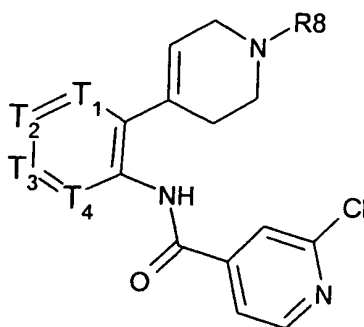


表 S10

化合物編號	R ⁸	T ₁	T ₂	T ₃	T ₄	Mp (°C)	MH ⁺	滯留時間 (分鐘)
S-10-1	4-氯苯烯丙基	N	C-Me	CH	CH		420/422	1.27
S-10-2	4-氯苯烯丙基	N	C-Me	CH	CH		525/526	1.29
S-10-3	4-氯苯烯丙基	N	C-Br	CH	N		546/548	1.37
S-10-4	4-氯苯烯丙基	CH	N	C-Cl	N		502/504	1.30
S-10-5	4-氯苯烯丙基	C-Cl	N	CH	CH		501/503	1.54
S-10-6	4-氯苯烯丙基	C-Cl	N	C-Cl	CH		535/537	1.63
S-10-7	4-氯苯烯丙基	CH	C-CF ₃	CH	N		533/535	1.39
S-10-8	4-氯苯烯丙基	N	C-Cl	CH	CH		501/503	1.34
S-10-9	4-溴苯烯丙基	N	C-Cl	CH	CH		545/547	1.36
S-10-10	4-氯苯烯丙基	S	CH	CH	-		470/472	1.38
S-10-11	4-氯苯烯丙基	S	C-Cl	CH	-		506/508	1.43

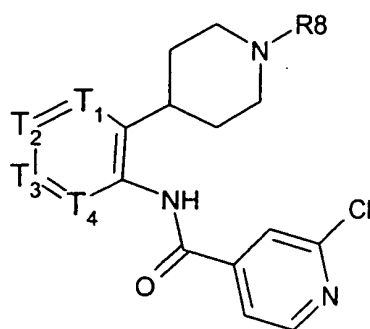


表 S11

化合物編號	R ⁸	T ₁	T ₂	T ₃	T ₄	Mp (°C)	MH ⁺	滯留時間 (分鐘)
S-11-1	4-氯苯烯丙基	N	C-Me	CH	CH		481/483	1.33
S-11-2	4-溴苯烯丙基	N	C-Me	CH	CH		527/529/530	1.33
S-11-3	4-氯苯烯丙基	CH	CF ₃	CH	N		535/537	1.35
S-11-4	4-溴苯烯丙基	CH	CF ₃	CH	N		581/528.5	1.36

實施例 24

這個實施例舉例說明式(I)化合物的除害／殺蟲性質。

如下完成測試抵抗：

海灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*) (埃及棉葉蟲)

棉花葉圓盤放置在 24-井微升碟中的瓊脂上和以 200 ppm 的施用率噴灑測試溶液。乾燥之後，該等葉圓盤以 5 隻 L₁ 幼蟲感染。處理 3 天後(DAT)檢查該等樣品之死亡率、驅逐效果、進食行為，和生長調節。下列化合物產生海灰翅夜蛾的至少 80% 控制：Iaaa-3 和 Iaaa-49。

菸草青蟲(*Heliothis virescens*)(煙夜蛾(tobacco budworm))：

蛋(0-24 小時大)放置在人工飲食上的 24-井微升碟中和藉由吸量以 200 ppm 的施用率之測試溶液處理。在 4 天的培育週期之後，檢查樣品之蛋死亡率、幼蟲死亡率和生長調節。下列化合物產生菸草青蟲的至少 80% 控制：Ia-49、Ia-50、Ia-53、Iaaa-3、Iaaa-26、Iaaa-49、Iaaa-52、Iaab-26 和、Iaac-26。

小菜蛾(*Plutella xylostella*)(吊絲蟲(diamond back moth))：

具有人工飲食的 24-井微升碟(MTP)藉由吸量以 18.2 ppm 的施用率之測試溶液處理。乾燥之後，以幼蟲(L2)(每井 10-25 隻)感染 MTP。在 5 天的培育週期之後，檢查樣品之幼蟲死亡率、拒食和生長調節。下列化合物產生小菜蛾的至少 80% 控制：Ia-49、Ia-53、Iaaa-3、Iaaa-26、Iaaa-49 和 Iaac-26。。

埃及斑蚊(*Aedes aegypti*)(黃熱病蚊子)：

10-25 隻斑蚊幼蟲(L2)和營養混合物一起放置在 96-井微升碟中。吸量 2ppm 的施用率之測試溶液至該等井內。2 天之後，檢查昆蟲之死亡率和生長抑制作用。下列化合物產生埃及斑蚊的至少 80% 控制：Ia-53、Iaaa-3、Iaaa-26、Iaaa-49、Iaaa-52、Iaab-26、Iaac-26 和 Iaai-26。

【圖式簡單說明】

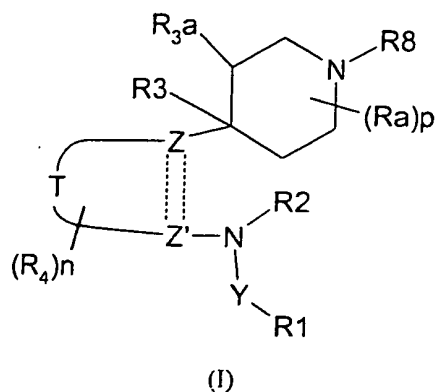
無

【主要元件符號說明】

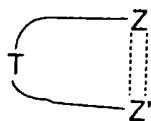
無

六、英文發明摘要：

The use of a compound of formula I



Y is a single bond, C=O, C=S or S(O)_m where m is 0, 1 or 2; the ring;



is a 6 membered aromatic ring or is a 5 or 6 membered heteroaromatic ring;

Z and Z' are $\begin{array}{c} | \\ =C- \end{array}$ or $\begin{array}{c} | \\ -N- \end{array}$ provided that both are not N; R¹, R², R³, R^{3a}, R⁴, R⁸ and Ra are specified organic groups and n and p are independently 0, 1, 2, 3 or 4; or salts or N-oxides thereof or compositions containing them in controlling insects, acarines, nematodes or molluscs, Novel compounds are also provided.

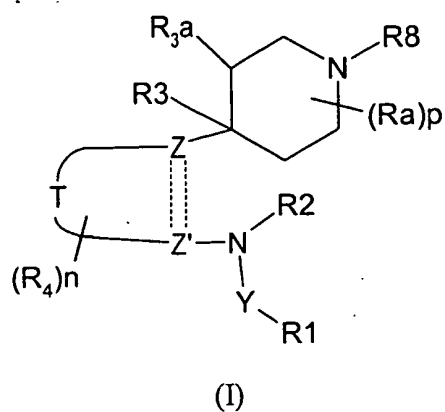
七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第（ 無 ）圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

無

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



96年7月1日修正替換頁

公告本

發明專利說明書

96年7月1日修正補充

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號： 94119610

※ 申請日期： 94.6.14

※ IPC 分類： A01N 43/40

一、發明名稱：(中文/英文)

化合物

CHEMICAL COMPOUNDS

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

先正達合夥公司 / SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

代表人：(中文/英文)

1. 喬瑟琳 塞若尼 / CERONI, JOCELYNE

2. 寇尼里亞 史基勒 / SCHILLER, CORNELIA

住居所或營業所地址：(中文/英文)

瑞士，4058 巴賽爾城，黑森林大道 215 號

Schwarzwaldallee 215, 4058 Basel, Switzerland

國 籍：(中文/英文)

瑞士 / SWITZERLAND

三、發明人：(共 6 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 彼得 梅恩費許 / MAIENFISCH, PETER

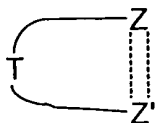
2. 路易斯皮耶 默雷爾斯 / MOLLEYRES, LOUIS-PIERRE

3. 耶羅姆 卡薩勒 / CASSAYRE, JEROME

4. 弗瑞德利克 塞德鮑 / CEDERBAUM, FREDRIK

5. 卡蜜拉 寇西 / CORSI, CAMILLA

6. 托瑪斯 皮特納 / PITTERNA, THOMAS



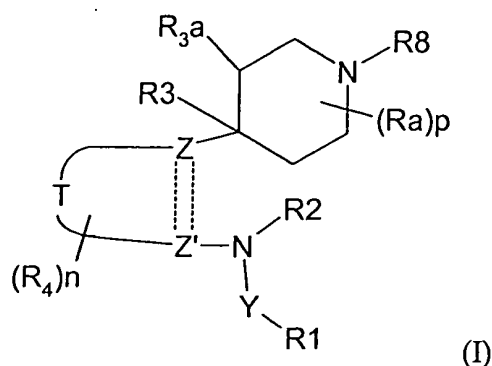
為 6 員芳族環或為 5 或 6 員雜芳族環；

Z 和 Z' 以單鍵或雙鍵連接且為 =C- 或 -N- ，其先決條件為二者不皆為 N；

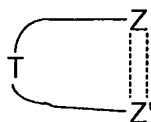
R^1 為氫、視需要地經取代之烷基、視需要地經取代之烷氧羰基、視需要地經取代之烷羰基、胺羰基、視需要地經取代之烷胺羰基、視需要地經取代之二烷胺羰基、視需要地經取代之芳基、視需要地經取代之雜芳基、視需要地經取代之烷氧基、視需要地經取代之芳氧基、視需要地經取代之雜芳氧基、視需要地經取代之雜環氧基、氰基、視需要地經取代之烯基、視需要地經取代之炔基、視需要地經取代之環烷基、視需要地經取代之環烯基、甲醯基、視需要地經取代之雜環基、視需要地經取代之烷硫基、NO 或 $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ ，其中 R^{13} 和 R^{14} 獨立地為氫、 COR^{15} 、視需要地經取代之烷基、視需要地經取代之芳基、視需要地經取代之雜芳基、視需要地經取代之雜環基或 R^{13} 和 R^{14} 與他們所連接之 N 原子一起形成基 $\text{-N=C(R}^{16}\text{)-NR}^{17}\text{R}^{18}$ 或 R^{13} 和 R^{14} 與他們所連接之 N 原子一起形成五、六或七員雜環，其可包含一或二個選自 O、N 或 S 之進一步雜原子及其可

五、中文發明摘要：

一種式 I 之化合物



其中 Y 為單鍵、C=O、C=S 或 S(O)_m，其中 m 為 0、1 或 2；該環

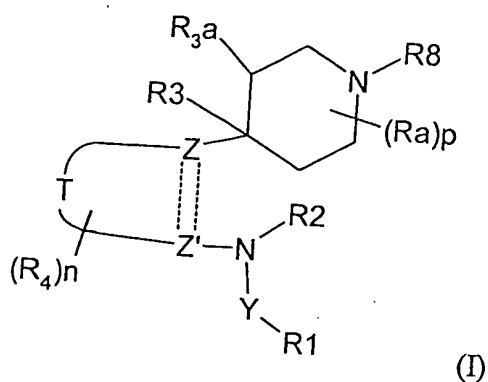


為 6 員芳族環或為 5 或 6 員雜芳族環；

Z 和 Z' 為 $\begin{array}{c} | \\ =C- \end{array}$ 或 $\begin{array}{c} | \\ -N- \end{array}$ ，其先決條件為二者不皆為 N；R¹、R²、R³、R^{3a}、R⁴、R⁸ 和 Ra 為特定有機基及 n 和 p 獨立為 0、1、2、3 或 4；或其鹽或 N-氧化物或含其之組成物於控制昆蟲、蠕、線蟲或軟體動物(molluscs)之用途。也提供新穎化合物。

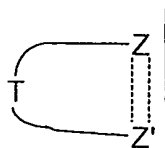
十、申請專利範圍：

1. 一種對抗和控制昆蟲、蟎、線蟲或軟體動物之方法，其包含將殺蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量之下式 I 化合物施用至有害生物、至有害生物之區域或至易受有害生物侵襲之植物：



其中 Y 為單鍵、C=O、C=S 或 S(O)_m，其中 m 為 0、1 或 2；

該環



為 6 員芳族環或為 5 或 6 員雜芳族環；

Z 和 Z' 以單鍵或雙鍵連接且為 $\begin{array}{c} | \\ =C- \end{array}$ 或 $\begin{array}{c} | \\ -N- \end{array}$ ，其先決條件為二者不皆為 N；

R¹ 為氫、視需要地經取代之烷基、視需要地經取代之

烷氧羰基、視需要地經取代之烷羰基、胺羰基、視需要地
 經取代之烷胺羰基、視需要地經取代之二烷胺羰基、視需
 要地經取代之芳基、視需要地經取代之雜芳基、視需要地
 經取代之烷氧基、視需要地經取代之芳氧基、視需要地經
 取代之雜芳氧基、視需要地經取代之雜環氧基、氰基、視
 需要地經取代之烯基、視需要地經取代之炔基、視需要地
 經取代之環烷基、視需要地經取代之環烯基、甲醯基、視
 需要地經取代之雜環基、視需要地經取代之烷硫基、NO 或
 $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ ，其中 R^{13} 和 R^{14} 獨立地為氫、 COR^{15} 、視需要地經
 取代之烷基、視需要地經取代之芳基、視需要地經取代之
 雜芳基、視需要地經取代之雜環基或 R^{13} 和 R^{14} 與他們所連
 接之 N 原子一起形成基 $-\text{N}=\text{C}(\text{R}^{16})-\text{NR}^{17}\text{R}^{18}$ 或 R^{13} 和 R^{14} 與他
 們所連接之 N 原子一起形成五、六或七員雜環，其可包含
 一或二個選自 O、N 或 S 之進一步雜原子及其視需要地經一
 或二個 C_{1-6} 烷基取代； R^{15} 為 H、視需要地經取代之烷基、
 視需要地經取代之烷氧基、視需要地經取代之芳基、視需
 要地經取代之芳氧基、視需要地經取代之雜芳基、視需要
 地經取代之雜芳氧基或 $\text{NR}^{19}\text{R}^{20}$ ； R^{16} 、 R^{17} 和 R^{18} 各自獨立
 地為 H 或低級烷基； R^{19} 和 R^{20} 獨立地為視需要地經取代之
 烷基、視需要地經取代之芳基或視需要地經取代之雜芳基；

R^2 為 H、羥基、視需要地經取代之烷氧基或視需要地
 經取代之烷基；或 R^1 和 R^2 與 Y 基和 N 一起形成 5-或 6-員
 雜環，其可視需要地包含一個選自 O、N 或 S 之進一步雜原
 子及其可視需要地經 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基或鹵素取代；

R^3 為 H、OH、鹵素或視需要地經取代之烷基；

R^{3a} 為 H 或 R^3 和 R^{3a} 一起形成一鍵；

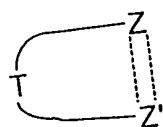
R^4 各自獨立地為鹵素、硝基、氰基、視需要地經取代之 C_{1-8} 烷基、視需要地經取代之 C_{2-6} 烯基、視需要地經取代之 C_{2-6} 炔基、視需要地經取代之烷氧羰基、視需要地經取代之烷羰基、視需要地經取代之烷胺羰基、視需要地經取代之二烷胺羰基、視需要地經取代之 C_{3-7} 環烷基、視需要地經取代之芳基、視需要地經取代之雜芳基、視需要地經取代之雜環基、視需要地經取代之烷氧基、視需要地經取代之芳氧基、視需要地經取代之雜芳氧基、視需要地經取代之烷硫基或 $R^{21}R^{22}N$ ，其中 R^{21} 和 R^{22} 獨立地為氫、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-7} 環烷基、 C_{3-6} 烯基、 C_{3-6} 炔基、 C_{3-7} 環烷基 (C_{1-4}) 烷基、 C_{2-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基、 C_{1-6} 烷氧羰基或 R^{21} 和 R^{22} 與他們所連接之 N 原子一起形成五、六或七-員雜環，其可包含一或二個選自 O、N 或 S 之進一步雜原子和其可視需要地經一或二個 C_{1-6} 烷基取代，或 2 個相鄰的 R^4 基與他們所連接之碳原子一起形成 4、5、6 或 7 員碳環或雜環，其可視需要地經鹵素取代；n 為 0、1、2、3 或 4；

R^8 為視需要地經取代之烷基、視需要地經取代之烯基、視需要地經取代之炔基、視需要地經取代之環烷基、視需要地經取代之芳基、視需要地經取代之烷氧基、視需要地經取代之芳氧基、視需要地經取代之烷氧羰基、視需要地經取代之烷羰基或視需要地經取代之烯羰基；

Ra 各自獨立地為鹵素、羥基、氰基、視需要地經取代

之 C_{1-8} 烷基、視需要地經取代之 C_{2-6} 烯基、視需要地經取代之 C_{2-6} 炔基、視需要地經取代之烷氧羰基、視需要地經取代之烷羰基、視需要地經取代之烷胺羰基、視需要地經取代之二烷胺羰基、視需要地經取代之 C_{3-7} 環烷基、視需要地經取代之芳基、視需要地經取代之雜芳基、視需要地經取代之雜環基、視需要地經取代之烷氧基、視需要地經取代之芳氧基、視需要地經取代之雜芳氧基、視需要地經取代之烷硫基、視需要地經取代之芳硫基或 $R^{23}R^{24}N$ ，其中 R^{23} 和 R^{24} 獨立地為氫、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-7} 環烷基、 C_{3-6} 烯基、 C_{3-6} 炔基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-4})烷基、 C_{2-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧羰基或 R^{23} 和 R^{24} 與他們所連接之 N 原子一起形成五、六或七-員雜環，其可包含一或二個選自 O、N 或 S 之進一步雜原子和其可視需要地經一或二個 C_{1-6} 烷基取代，或二個連接至相同碳原子之 Ra 基為 $=O$ 、 $=S$ 、 $=NRb$ 、 $=CRcRd$ ，其中 Rb、Rc 和 Rd 獨立地為 H 或視需要地經取代之烷基；p 為 0、1、2、3 或 4 或其鹽或 N-氧化物。

2. 根據申請專利範圍第 1 項之方法，其中該環



為 6 員芳族環或為 5 或 6 員雜芳族環，其中該環成員各自獨立地為 CH、S、N、 NR^4 、O 或 CR^4 ，其先決條件為至少一個環成員為非 CH 或 CR^4 和沒有超過一個 O 或 S 原

子存在於環中。

3. 根據申請專利範圍第 1 或 2 項之方法，其中 Y 為單鍵、C=O 或 C=S。

4. 根據申請專利範圍第 1 或 2 項之方法，其中 R¹ 為氫、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 氰基烷基、C₁₋₆ 鹵烷基、C₃₋₇ 環烷基(C₁₋₄)烷基、C₁₋₆ 烷氧基(C₁₋₆)烷基、雜芳基(C₁₋₆)烷基(其中雜芳基可視需要地經鹵基、硝基、氰基、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 鹵烷基、C₁₋₆ 烷氧基、C₁₋₆ 鹵烷氧基、C₁₋₆ 烷磺醯基、C₁₋₆ 烷亞磺醯基、C₁₋₆ 烷硫基、C₁₋₆ 烷氧羰基、C₁₋₆ 烷羰胺基、芳羰基取代，或在雜芳基系統上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)、芳基(C₁₋₆)烷基(其中芳基可視需要地經鹵基、硝基、氰基、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 鹵烷基、C₁₋₆ 烷氧基、C₁₋₆ 鹵烷氧基、C₁₋₆ 烷磺醯基、C₁₋₆ 烷亞磺醯基、C₁₋₆ 烷硫基、C₁₋₆ 烷氧羰基、C₁₋₆ 烷羰胺基、芳羰基取代，或在芳基系統上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)、C₁₋₆ 烷羰胺基(C₁₋₆)烷基、芳基(其可視需要地經鹵基、硝基、氰基、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 鹵烷基、C₁₋₆ 烷氧基、C₁₋₆ 鹵烷氧基、C₁₋₆ 烷磺醯基、C₁₋₆ 烷亞磺醯基、C₁₋₆ 烷硫基、C₁₋₆ 烷氧羰基、C₁₋₆ 烷羰胺基、芳羰基取代，或在芳基系統上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)、雜芳基(其可視需要地經鹵基、硝基、氰基、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 鹵烷基、C₁₋₆ 烷氧基、C₁₋₆ 鹵烷氧基、C₁₋₆ 烷磺醯基、C₁₋₆ 烷亞磺醯基、C₁₋₆ 烷硫

基、C₁₋₆ 烷氧羰基、C₁₋₆ 烷羰胺基、芳羰基取代，或在雜芳基系統上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)、C₁₋₆ 烷氧基、C₁₋₆ 鹵烷氧基、苯氧基(其中苯基視需要地經鹵素、C₁₋₄ 烷基、C₁₋₄ 烷氧基、C₁₋₄ 鹵烷基、C₁₋₄ 鹵烷氧基、CN、NO₂、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、雜芳氧基(視需要地經鹵基、硝基、氰基、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 鹵烷基、C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 鹵烷氧基取代)、雜環氧基(視需要地經鹵基、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 鹵烷基、C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 鹵烷氧基取代)、氰基、C₂₋₆ 烯基、C₂₋₆ 炔基、C₃₋₆ 環烷基、C₅₋₇ 環烯基、雜環基(視需要地經鹵基、硝基、氰基、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 鹵烷基、C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 鹵烷氧基取代)、C₁₋₆ 烷硫基、C₁₋₆ 鹵烷硫基或 NR¹³R¹⁴，其中 R¹³ 和 R¹⁴ 獨立地為氫、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 鹵烷基、C₁₋₆ 烷氧基(C₁₋₆)烷基、苯基(其可視需要地經鹵素、C₁₋₄ 烷基、C₁₋₄ 烷氧基、C₁₋₄ 鹵烷基、C₁₋₄ 鹵烷氧基、CN、NO₂、芳基、雜芳基、胺基、二烷胺基或 C₁₋₄ 烷氧羰基取代)、苯基(C₁₋₆)烷基(其中苯基可視需要地經鹵素、C₁₋₄ 烷基、C₁₋₄ 烷氧基、C₁₋₄ 鹵烷基、C₁₋₄ 鹵烷氧基、CN、NO₂、芳基、雜芳基、胺基、二烷胺基、C₁₋₆ 烷磺醯基、C₁₋₆ 烷氧羰基取代，或在苯基環上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)、雜芳基(C₁₋₆)烷基(其中雜芳基可視需要地經鹵基、硝基、氰基、C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 鹵烷基、C₁₋₆ 烷氧基、C₁₋₆ 鹵烷氧基、C₁₋₆ 烷磺醯基、C₁₋₆ 烷亞磺醯基、C₁₋₆ 烷硫基、C₁₋₆ 烷氧羰基、C₁₋₆ 烷

羰胺基、芳羰基取代，或在雜芳基系統上的二個相鄰位置可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環，其本身視需要地經鹵素取代)或雜芳基(其可視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代、 C_{1-4} 烷氧羰基 C_{1-6} 烷羰胺基、苯氧羰胺基(其中苯基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、胺基、 C_{1-6} 烷胺基或苯胺基(其中苯基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代))。

5. 根據申請專利範圍第 1 或 2 項之方法，其中 R^2 為氫、羥基、 C_{1-6} 烷基或 C_{1-6} 鹵烷基。

6. 根據申請專利範圍第 1 或 2 項之方法，其中 R^4 各自獨立地為鹵素、氰基、 C_{1-8} 烷基、 C_{1-8} 鹵烷基、 C_{1-6} 氰基烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-6})烷基、 C_{5-6} 環烯基(C_{1-6})烷基、 C_{3-6} 烯氧基(C_{1-6})烷基、 C_{3-6} 炔氧基(C_{1-6})烷基、芳氧基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 羧烷基、 C_{1-6} 烷羰基(C_{1-6})烷基、 C_{2-6} 烯羰基(C_{1-6})烷基、 C_{2-6} 炔羰基(C_{1-6})-烷基、 C_{1-6} 烷氧羰基(C_{1-6})烷基、 C_{3-6} 烯氧羰基(C_{1-6})烷基、 C_{3-6} 炔氧羰基(C_{1-6})烷基、芳氧羰基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷硫基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷亞磺基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷磺基(C_{1-6})烷基、胺羰基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷胺羰基(C_{1-6})烷基、二(C_{1-6})烷胺羰基(C_{1-6})烷基、苯基(C_{1-4})烷基(其中苯基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、

芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、雜芳基(C_{1-4})烷基(其中雜芳基視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、雜環基(C_{1-4})烷基(其中雜環基視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、 C_{2-6} 烯基、胺羧基(C_{2-6})烯基、 C_{1-6} 烷胺羧基(C_{2-6})烯基、二(C_{1-6})烷胺羧基(C_{2-6})烯基、苯基(C_{2-4})-烯基，(其中苯基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、 C_{2-6} 炔基、三甲基甲矽烷基(C_{2-6})炔基、胺羧基(C_{2-6})炔基、 C_{1-6} 烷胺羧基(C_{2-6})炔基、二(C_{1-6})烷胺羧基(C_{2-6})炔基、 C_{1-6} 烷氧羧基、 C_{3-7} 環烷基、 C_{3-7} 鹵環烷基、 C_{3-7} 氰基環烷基、 C_{1-3} 烷基(C_{3-7})-環烷基、 C_{1-3} 烷基(C_{3-7})鹵環烷基、苯基(視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、雜芳基(視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、雜環基(其中雜環基視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)，或 2 個相鄰基 R^4 與他們所連接之碳原子一起形成 4、5、6 或 7 員碳環或雜環，其可視需要地經鹵素、 C_{1-8} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、苯氧基(視需要地鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、雜芳氧基(視需要地經鹵基、硝基、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、 C_{1-8}

烷硫基或 $R^{19}R^{20}N$ 取代，其中 R^{19} 和 R^{20} 獨立地為氫、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-7} 環烷基、 C_{3-6} 烯基、 C_{3-6} 炔基、 C_{2-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧羰基或 R^{19} 和 R^{20} 與他們所連接之 N 原子一起形成五、六或七-員雜環，其可包含一或二個選自 O、N 或 S 之進一步雜原子和其可視需要地經一或二個 C_{1-6} 烷基取代；n 為 0、1、2 或 3。

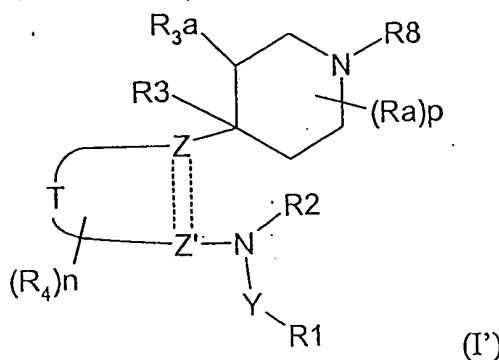
7. 根據申請專利範圍第 1 或 2 項之方法，其中 R^8 為 C_{1-10} 烷基、 C_{1-10} 鹵烷基、芳基(C_{1-6})烷基(其中芳基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、雜芳基(C_{1-6})烷基(其中雜芳基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、芳羰基-(C_{1-6})烷基(其中芳基可視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代和烷基可視需要地經芳基取代)、 C_{2-8} 烯基、 C_{2-8} 鹵烯基、芳基(C_{2-6})-烯基(其中芳基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基、 C_{1-6} 烷氧羰基取代，或二個相鄰取代基可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環)、雜芳基(C_{2-6})-烯基(其中雜芳基視需要地經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基、 C_{1-6} 烷氧羰基取代，或二個相鄰取代基可環化以形成一種 5、6 或 7 員碳環或雜環)、 C_{2-6} 炔基、

苯基(C₂₋₆)炔基(其中苯基視需要地經鹵素、C₁₋₄ 烷基、C₁₋₄ 烷氧基、C₁₋₄ 鹵烷基、C₁₋₄ 鹵烷氧基、CN、NO₂、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)、C₃₋₇ 環烷基、C₁₋₆ 烷氧羰基、C₁₋₆ 烷羰基、C₁₋₆ 鹵烷羰基或芳基(C₂₋₆)烯羰基(其中芳基可視需要地經鹵素、C₁₋₄ 烷基、C₁₋₄ 烷氧基、C₁₋₄ 鹵烷基、C₁₋₄ 鹵烷氧基、CN、NO₂、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)，或 -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵，其中 z 為 1 或 2，R⁵¹ 和 R⁵² 各自獨立地為 H、鹵基或 C₁₋₂ 烷基、R⁵³ 和 R⁵⁴ 各自獨立地為 H、鹵素、C₁₋₄ 烷基或 C₁₋₄ 鹵烷基和 R⁵⁵ 為視需要地經取代之芳基或視需要地經取代之雜芳基。

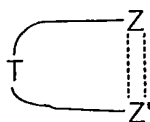
8. 根據申請專利範圍第 1 或 2 項之方法，其中 Ra 獨立地為鹵基、氰基、C₁₋₃ 烷基、羥基或二個 Ra 基與他們所連接之碳原子一起形成=O、=S、=NRb、=CRcRd，其中 Rb、Rc 和 Rd 獨立地為 H 或視需要地經取代之烷基；及 p 為 0、1 或 2。

9. 根據申請專利範圍第 1 或 2 項之方法，其中 R³ 為氫、羥基、鹵素、C₁₋₆ 烷基或 C₁₋₆ 鹵烷基及 R^{3a} 為氫或 R³ 和 R^{3a} 一起形成雙鍵。

10. 一種式 I' 之化合物，

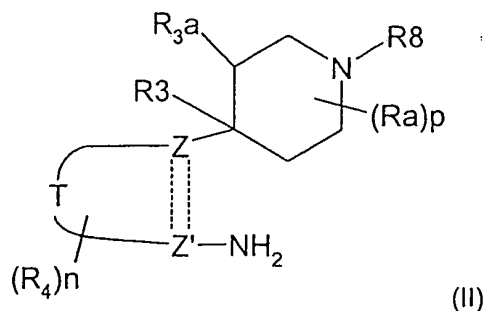


其中；該環



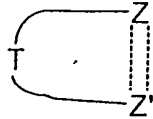
及 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^{3a} 、 R^4 、 R_a 、 Y 、 n 和 p 如申請專利範圍第 1 項中式 I 之相關定義及 R^8 為 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_Z-R^{55}$ ，其中 z 為 1 或 2， R^{51} 和 R^{52} 各自獨立地為 H 或 C_{1-2} 烷基， R^{53} 和 R^{54} 各自獨立地為 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基和 R^{55} 為經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代之苯基或經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代之雜芳基，或其鹽或 N-氧化物。

11. 一種式 II 之化合物，



(II)

其中；該環



及 R^3 、 R^{3a} 、 R^4 、 R^8 、 Ra 、 n 和 p 如申請專利範圍第 10 項中的式 I' 之相關定義。

12. 一種殺蟲、殺蟎和殺線蟲組成物，其包含殺蟲、殺蟎或殺線蟲有效量之如申請專利範圍第 10 項所定義的式 I' 化合物。

十一、圖式：

如次頁