

發明專利說明書

中文說明書替換頁(100年3月)

(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：092115698

※ 申請日期：92.06.10.

※IPC 分類：A01N43/40

壹、發明名稱：(中文/英文)

螺吡啉哌啉化合物、使用其防治昆蟲、蟎蟲、線蟲及軟體動物之方法，以及含彼之組合物 SPIROINDOLINE COMPOUNDS, METHODS OF USING THEM TO COMBAT AND CONTROL INSECTS, ACARINES, NEMATODES AND MOLLUSCS, AND COMPOSITIONS COMPRISING THE SAME

貳、申請人：(共 2 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

1. 英商辛堅塔股份有限公司
SYNGENTA LIMITED
2. 瑞士商諾華國際作物公司
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

代表人：(中文/英文)

1. 瑞格莉特 安 魯德
MARGARET ANN RUDD
2. 瑞格麗特 安 魯德
MARGARET ANN RUDD

住居所或營業所地址：(中文/英文)

1. 英國雪瑞郡古爾佛德市普里斯利路雪瑞研究公園
EUROPEAN REGIONAL CENTRE, PRIESTLEY ROAD,
SURREY RESEARCH PARK, GUILDFORD, SURREY GU2 7YH,
UNITED KINGDOM
2. 瑞士貝斯爾市雪瓦爾達伊路 215 號
INTELLECTUAL PROPERTY SCHWARZWALDALLEE 215
CH-4058 BASEL SWITZERLAND

國籍：(中文/英文)

1. 英國 UNITED KINGDOM
2. 瑞士 SWITZERLAND

參、發明人：(共 12 人)**姓 名：**(中文/英文)

1. 大衛 約翰 修斯
DAVID JOHN HUGHES
2. 保羅 安東尼 沃辛頓
PAUL ANTHONY WORTHINGTON
3. 查爾斯 亞當 盧希歐
CHARLES ADAM RUSSELL
4. 艾瑞克 丹尼爾 克拉克
ERIC DANIEL CLARKE
5. 詹姆士 艾德華 匹斯
JAMES EDWARD PEACE
6. 李查 史普瑞 羅伯茲
RICHARD SPURRING ROBERTS
7. 馬克 李查 安須頓
MARK RICHARD ASHTON
8. 湯瑪斯 史帝芬 寇特
THOMAS STEPHEN COULTER
9. 路易世-皮耳 莫利瑞斯
LOUIS-PIERRE MOLLEYRES
10. 佛萊德瑞克 西德鮑
FREDRIK CEDERBAUM
11. 傑諾密 卡沙瑞
JEROME CASSAYRE
12. 比德 曼菲奇
PETER MAIENFISCH

住居所地址：(中文/英文)

1. 英國柏克夏郡布萊克尼爾市吉洛特崗國際研究中心
JEALOTT'S HILL INTERNATIONAL RESEARCH CENTRE,
BRACKNELL, BERKSHIRE RG42 6EY, U. K.
2. 英國柏克夏郡布萊克尼爾市吉洛特崗國際研究中心
JEALOTT'S HILL INTERNATIONAL RESEARCH CENTRE,
BRACKNELL, BERKSHIRE RG42 6EY, U. K.

3. 英國柏克夏郡布萊克尼爾市吉洛特崗國際研究中心
JEALOTT'S HILL INTERNATIONAL RESEARCH CENTRE,
BRACKNELL, BERKSHIRE RG42 6EY, U. K.
4. 英國柏克夏郡布萊克尼爾市吉洛特崗國際研究中心
JEALOTT'S HILL INTERNATIONAL RESEARCH CENTRE,
BRACKNELL, BERKSHIRE RG42 6EY, U. K.
5. 英國柏克夏郡布萊克尼爾市吉洛特崗國際研究中心
JEALOTT'S HILL INTERNATIONAL RESEARCH CENTRE,
BRACKNELL, BERKSHIRE RG42 6EY, U. K.
6. 西班牙巴塞隆那市卡丹納街 68-74
CARDENER, 68-74 08024 BARCELONA, SPAIN
7. 英國牛津市阿賓登路米歐頓公園
MILTON PARK, ABINGDON, OXON OX14 4SD, U. K.
8. 英國牛津市阿賓登路米歐頓公園
MILTON PARK, ABINGDON, OXON OX14 4SD, U. K.
9. 瑞士巴索市
CH-4058 BASEL, SWITZERLAND
10. 瑞士巴索市
CH-4058 BASEL, SWITZERLAND
11. 瑞士巴索市
CH-4058 BASEL, SWITZERLAND
12. 瑞士巴索市
CH-4058 BASEL, SWITZERLAND

國 籍：(中文/英文)

1. 英國 UNITED KINGDOM
2. 英國 UNITED KINGDOM
3. 英國 UNITED KINGDOM
4. 英國 UNITED KINGDOM
5. 英國 UNITED KINGDOM
6. 英國 UNITED KINGDOM
7. 英國 UNITED KINGDOM
8. 英國 UNITED KINGDOM
9. 瑞士 SWITZERLAND
10. 瑞士 SWITZERLAND
11. 瑞士 SWITZERLAND
12. 瑞士 SWITZERLAND

肆、聲明事項：

本案係符合專利法第二十條第一項 第一款但書或 第二款但書規定之期間，其日期為： 年 月 日。

本案申請前已向下列國家（地區）申請專利：

1. 英國；2002年06月14日；0213715.6

2.

3.

4.

5.

主張國際優先權(專利法第二十四條)：

【格式請依：受理國家（地區）；申請日；申請案號數 順序註記】

1. 英國；2002年06月14日；0213715.6

2.

3.

4.

5.

主張國內優先權(專利法第二十五條之一)：

【格式請依：申請日；申請案號數 順序註記】

1.

2.

主張專利法第二十六條微生物：

國內微生物 【格式請依：寄存機構；日期；號碼 順序註記】

國外微生物 【格式請依：寄存國名；機構；日期；號碼 順序註記】

熟習該項技術者易於獲得，不須寄存。

玖、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係有關螺吡啶生物，其製法及含其之殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲與殺軟體動物之化合物及其於防治昆蟲、蟎、軟體動物與線蟲等有害生物上之用途。

【先前技術】

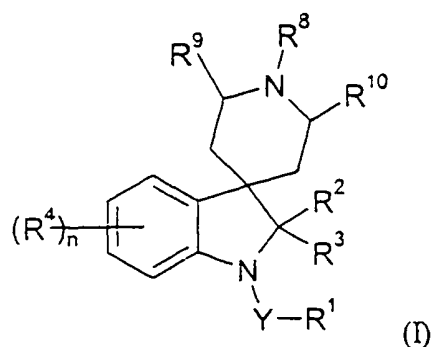
具有醫藥性質之螺吡啶生物揭示於例如：WO 9825605、WO 9429309、WO 9828297與WO 9964002。具備醫藥性質之特定化合物之合成途徑說明於Proc. Natl. Acad. Sci. USA(1995), 92, 7001、Tetrahedron (1997), 53, 10983與Tetrahedron Letters (1997), 38, 1497。

【發明內容】

現已驚人地發現，某些螺吡啶具有殺昆蟲性質。因此，本發明提供一種防治昆蟲、蟎、軟體動物或線蟲之方法，其包括對該有害生物、有害生物之所在地或容易受有害生物侵害之植物施用殺昆蟲、殺蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量之化合物：

【實施方式】

本發明之式(I)化合物



(I)

其中Y為單鍵、C=O、C=S或S(O)_q，其中q為0、1或2；R¹為氫、可視需要經取代之烷基、可視需要經取代之烷氧羰基、可視需要經取代之烷羰基、胺羰基、可視需要經取代之烷胺羰基、可視需要經取代之二烷胺羰基、可視需要經取代之芳基、可視需要經取代之雜芳基、可視需要經取代之烷氧基、可視需要經取代之芳氧基、可視需要經取代之雜芳氧基、可視需要經取代之雜環氧基、氰基、可視需要經取代之烯基、可視需要經取代之炔基、可視需要經取代之環烷基、可視需要經取代之環烯基、甲醯基、可視需要經取代之雜環基、可視需要經取代之烷硫基、NO或NR¹³R¹⁴，其中R¹³與R¹⁴分別獨立為氫、COR⁴⁰、可視需要經取代之烷基、可視需要經取代之芳基、可視需要經取代之雜芳基、可視需要經取代之雜環基或R¹³與R¹⁴與其所附接之氮原子共同形成基團-N=C(R⁴¹)-NR⁴²R⁴³；R²與R³分別獨立為氫、鹵素、氰基、可視需要經取代之烷基、可視需要經取代之烷氧基、可視需要經取代之芳基或C(O)NR¹⁵R¹⁶，其中R¹⁵與R¹⁶分別獨立為氫、可視需要經取代之烷基、可視需要經取代之芳基、可視需要經取代之雜芳基或可視需要經取代之雜環基，或R²與R³共同為=O，或R²與R³與其所附接之原子共同形成4、5、6或7員碳環系或雜環系環；各R⁴分別獨立為鹵素、硝基、氰基、可視需要經取代之C₁₋₈烷基、可視需要經取代之C₂₋₆烯基、可視需要經取代之C₂₋₆炔基、可視需要經取代之烷氧羰基、可視需要經取代之烷羰基、可視需要經取代之烷胺羰基、可視需要經取代之二烷胺羰基、

可視需要經取代之 C_{3-7} 環烷基、可視需要經取代之芳基、可視需要經取代之雜芳基、可視需要經取代之雜環基、可視需要經取代之烷氧基、可視需要經取代之芳氧基、可視需要經取代之雜芳氧基、可視需要經取代之烷硫基或 $R^{19}R^{20}N$ ，其中 R^{19} 與 R^{20} 分別獨立為氫、 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^{19} 與 R^{20} 與其所附接之氮原子共同形成5、6或7員雜環，其可另包含1或2個選自選自：O、N或S之雜原子且可視需要經1或2個 C_{1-6} 烷基取代，或2個相鄰 R^4 基團與其相鄰碳原子共同形成4、5、6或7員碳環系或雜環系環，其可視需要經鹵素取代；n為0、1、2、3或4； R^8 為可視需要經取代之烷基、可需要經取代之烯基、可視需要經取代之炔基、可視需要經取代之環烷基、可視需要經取代之芳基、可視需要經取代之烷氧基、可視需要經取代之芳氧基、可視需要經取代之烷氧羰基、可視需要經取代之烷羰基或可視需要經取代之烯羰基； R^9 與 R^{10} 分別獨立為氫、鹵素、可視需要經取代之烷基、可視需要經取代之芳基或 R^9 與 R^{10} 共同形成基團 $-CH_2-$ 、 $-CH=CH-$ 或 $-CH_2CH_2-$ ； R^{40} 為H、可視需要經取代之烷基、可視需要經取代之烷氧基、可視需要經取代之芳基、可視需要經取代之芳氧基、可視需要經取代之雜芳基、可視需要經取代之雜芳氧基或 $NR^{44}R^{45}$ ； R^{41} 、 R^{42} 與 R^{43} 分別獨立為H或低碳數烷基； R^{44} 與 R^{45} 分別獨立為可視需要經取代之烷基、可視需要經取代之芳基或可視需要經取代之雜芳基或其鹽或N-氧化物。

式(I)化合物可能出現不同幾何或光學異構物或互變異構物型。本發明涵括所有此等異構物與互變異構物及其所有比例之混合物與同位素型，如：氘化化合物。

各烷基部份基團不論單獨或作為大型基團之一部份時(如：烷氧基、烷氧羰基、烷羰基、烷胺羰基、二烷胺羰基)均可為直鏈或分支鏈，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、第二丁基、異丁基、第三丁基或新戊基。

若烷基部份基團(不論單獨或作為大型基團之一部份如：烷氧基、烷氧羰基、烷羰基、烷胺羰基、二烷胺羰基)上具有可視需要選用之取代基時，該取代基可包括一個或多個鹵素、硝基、氰基、NCS-、C₃₋₇環烷基(其本身可視需要經C₁₋₆烷基或鹵素取代)、C₅₋₇環烯基(其本身可視需要經C₁₋₆烷基或鹵素取代)、羥基、C₁₋₁₀烷氧基、C₁₋₁₀烷氧基(C₁₋₁₀)烷氧基、三(C₁₋₄)烷矽烷基(C₁₋₆)烷氧基、C₁₋₆烷氧羰基(C₁₋₁₀)烷氧基、C₁₋₁₀鹵烷氧基、芳基(C₁₋₄)烷氧基(其中芳基可視需要經取代)、C₃₋₇環烷氧基(其中環烷基可視需要經C₁₋₆烷基或鹵素取代)、C₂₋₁₀烯氧基、C₂₋₁₀炔氧基、SH、C₁₋₁₀烷硫基、C₁₋₁₀鹵烷硫基、芳基(C₁₋₄)烷硫基(其中芳基可視需要經取代)、C₃₋₇環烷硫基(其中環烷基可視需要經C₁₋₆烷基或鹵素取代)、三(C₁₋₄)烷矽烷基(C₁₋₆)烷硫基、芳硫基(其中芳基可視需要經取代)、C₁₋₆烷磺醯基、C₁₋₆鹵烷磺醯基、C₁₋₆烷亞磺醯基、C₁₋₆鹵烷亞磺醯基、芳磺醯基(其中芳基可視需要經取代)、三(C₁₋₄)烷矽烷基、芳基二(C₁₋₄)烷矽烷基、(C₁₋₄)

烷基二芳矽烷基、三芳矽烷基、 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(其中芳基可視需要經取代)、二(C_{1-6})烷胺羰氧基、肟如： $=NO$ 烷基、 $=NO$ 鹵烷基與 $=NO$ 芳基(其本身可視需要經取代)、芳基(其本身可視需要經取代)、雜芳基(其本身可視需要經取代)、雜環基(其本身可視需要經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、芳氧基(其中芳基可視需要經取代)、雜芳氧基(其中雜芳基可視需要經取代)、雜環氧基(其中雜環基可視需要經 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(其中芳基可視需要經取代)與芳羰基(其中芳基可視需要經取代)。

烯基與炔基部份基團可呈直鏈或分支鏈，且烯基部份基團中若適當時，可為(E)-或(Z)-組態。其實例為乙烯基、烯丙基與炔丙基。

若烯基或炔基上具有可視需要選用之取代基時，該取代基包括彼等上述烷基部份基團所述之取代基。

本說明書中，醯基為可視需要經取代之 C_{1-6} 烷羰基(例如：乙醯基)、可視需要經取代之 C_{2-6} 烯羰基、可視需要經取代之 C_{2-6} 炔羰基、可視需要經取代之芳羰基(例如：苯甲醯基)或可視需要經取代之雜芳羰基。

鹵素為氟、氯、溴或碘。

鹵烷基為經一個或多個相同或相異鹵原子取代之烷基，例如： CF_3 、 CF_2Cl 、 CF_3CH_2 或 CHF_2CH_2 。

本說明書中，"芳基"與"芳香環系"指可為單環、雙環或三環之環系。此等環之實例包括苯基、萘基、蔥基、茛基或菲基。較佳芳基為苯基。此外，"雜芳基"、"雜芳香環"或"雜芳香環系"係指包含至少一個雜原子且由單一環或2個或更多個稠合環組成之芳香環系。較佳為包含至多3個雜原子之單環及至多4個雜原子之雙環，該雜原子最好選自氮、氧與硫。此等基團實例包括呋喃、噻吩基、吡咯基、吡啶基、咪啶基、1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、嘧啶基、異嘧啶基、噻唑基、異噻唑基、1,2,3-嘧二唑基、1,2,4-嘧二唑基、1,3,4-嘧二唑基、1,2,5-嘧二唑基、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、吡嗪基、1,2,3-三吡基、1,2,4-三吡基、1,3,5-三吡基、苯並呋喃基、苯並異呋喃基、苯並噻吩基、苯並異噻吩基、吡啶基、異吡啶基、吡啶基、苯並噻唑基、苯並異噻唑基、苯並嘧啶基、苯並異嘧啶基、苯並咪啶基、喹啉基、異喹啉基、噌啉基、酞吡基、喹啉基、喹啉基、萘啶基、苯並三吡基、嘌呤基、蝶啶基與吡嗪基。雜芳香基較佳實例包括吡啶基、嘧啶基、三吡基、噻吩基、呋喃基、嘧啶基、異嘧啶基與噻唑基。

雜環與雜環基係指包含至多10個原子(包括一個或多個(以1或2個較佳)選自：O、N或S之雜原子)之非芳香環。此等環實例包括1,3-二氧戊環、四氫呋喃與嗎啉。

若雜環基上具有可視需要選用之取代基時，該取代基包括C₁₋₆烷基與C₁₋₆鹵烷基及上述烷基部份基團所述及之彼等可選用之取代基。

環烷基包括環丙基、環戊基與環己基。

環烯基包括環戊烯基與環己烯基。

若環烷基或環烯基上具有可視需要選用之取代基時，該取代基包括C₁₋₃烷基及上述烷基部份基團所述及之彼等可選用之取代基。

碳環系環包括芳基、環烷基與環烯基。

若芳基或雜芳基上具有可視需要選用之取代基時，該取代基分別獨立選自：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(其本身可視需要經C₁₋₆烷基或鹵素取代)、C₅₋₇環烯基(其本身可視需要經C₁₋₆烷基或鹵素取代)、羥基、C₁₋₁₀烷氧基、C₁₋₁₀烷氧基(C₁₋₁₀)烷氧基、三(C₁₋₄)烷基-矽烷基(C₁₋₆)烷氧基、C₁₋₆烷氧羰基(C₁₋₁₀)烷氧基、C₁₋₁₀鹵烷氧基、芳基(C₁₋₄)烷氧基(其中芳基可視需要經鹵素或C₁₋₆烷基取代)、C₃₋₇環烷氧基(其中環烷基可視需要經C₁₋₆烷基或鹵素取代)、C₂₋₁₀烯氧基、C₂₋₁₀炔氧基、SH、C₁₋₁₀烷硫基、C₁₋₁₀鹵烷硫基、芳基(C₁₋₄)烷硫基、C₃₋₇環烷硫基(其中環烷基可視需要經C₁₋₆烷基或鹵素取代)、三(C₁₋₄)-烷矽烷基(C₁₋₆)烷硫基、芳硫基、C₁₋₆烷磺醯基、C₁₋₆鹵烷磺醯基、C₁₋₆烷亞磺醯基、C₁₋₆鹵烷亞磺醯基、芳磺醯基、三(C₁₋₄)烷矽烷基、芳基二(C₁₋₄)-烷矽烷基、(C₁₋₄)烷基二芳矽烷基

、三芳矽烷基、 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(其本身可視需要經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、雜芳基(其本身可視需要經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、雜環基(其本身可視需要經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、芳氧基(其中芳基可視需要經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、雜芳氧基(其中雜芳基可視需要經 C_{1-6} 烷基或鹵素取代)、雜環氧基(其中雜環基可視需要經 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(其中芳基本身可視需要經鹵素或 C_{1-6} 烷基取代)或芳基或雜芳基系上兩個相鄰位置可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環，其本身可視需要經鹵素或 C_{1-6} 烷基取代。芳基或雜芳基之其他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)、雜環基胺基(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-(C₁₋₆)烷胺羰基，其中芳基經C₁₋₆烷基或鹵素取代)、C₁₋₆烷胺羰基-N-(C₁₋₆)烷胺基、二(C₁₋₆)烷胺羰基-N-(C₁₋₆)烷胺基、芳胺羰基-N-(C₁₋₆)烷胺基(其中芳基經C₁₋₆烷基或鹵素取代)及芳基-N-(C₁₋₆)烷胺羰基-N-(C₁₋₆)烷胺基(其中芳基經C₁₋₆烷基或鹵素取代)。

經取代之苯基部份基團、雜環基與雜芳基中一個或多個取代基最好分別獨立選自鹵素、C₁₋₆烷基、C₁₋₆鹵烷基、C₁₋₆烷氧基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆鹵烷氧基、C₁₋₆烷硫基、C₁₋₆鹵烷硫基、C₁₋₆烷亞磺醯基、C₁₋₆鹵烷亞磺醯基、C₁₋₆烷磺醯基、C₁₋₆鹵烷磺醯基、C₂₋₆烯基、C₂₋₆鹵烯基、C₂₋₆炔基、C₃₋₇環烷基、硝基、氰基、CO₂H、C₁₋₆烷羰基、C₁₋₆烷氧羰基、R³¹R³²N或R³³R³⁴NC(O)；其中R³¹、R³²、R³³與R³⁴分別獨立為氫或C₁₋₆烷基。其他較佳取代基為胺基、二烷胺基、芳基與雜芳基。

鹵烯基為經一個或多個相同或相異之鹵原子取代之烯基。

咸了解，二烷胺基取代基包括彼等其中二烷基與其所附接之氮原子共同形成可另包含1或2個選自O、N或S之雜原子且可視需要經1或2個分別獨立選自(C₁₋₆)烷基之取代基取代之5、6或7員雜環。當雜環系環由N原子上兩個基團結合形成時，所得之環宜為吡咯啉、六氫吡啉、硫嗎啉與嗎啉，其各可經1或2個分別獨立選自(C₁₋₆)烷基之取代基取代。

烷基部份基團上可視需要選用之取代基包括一個或多個鹵素、硝基、氰基、HO₂C、C₁₋₁₀烷氧基(其本身可視需要經

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、可視需要經取代之苯基、雜芳基、芳氧基、芳基羰氧基、雜芳氧基、雜環基、雜環氧基、C₃₋₇環烷基(其本身可視需要經(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)烷矽烷基、三(C₁₋₄)烷矽烷基(C₁₋₆)烷氧基、芳基二(C₁₋₄)烷矽烷基、(C₁₋₄)烷基二芳矽烷基與三芳矽烷基。

烯基或炔基上可視需要選用之取代基包括一個或多個鹵素、C₃₋₇環烷基與芳基；芳基可視需要經鹵素、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。

雜環基之較佳之視需要選用之取代基為C₁₋₆烷基。

環烷基之較佳之視需要選用之取代基包括鹵素、氰基與C₁₋₃烷基。

環烯基之較佳之視需要選用之取代基包括C₁₋₃烷基、鹵素與氰基。

一種較佳式(IA)化合物為彼等式(I)化合物中，Y為單鍵、C=O、C=S或S(O)_q，其中q為0、1或2；R¹為氫、可視需要經取代之烷基、可視需要經取代之烷氧羰基、可視需要經取代之烷羰基、胺羰基、可視需要經取代之烷胺羰基、可視需要經取代之二烷胺羰基、可視需要經取代之芳基、可視需要經取代之雜芳基、可視需要經取代之烷氧基、可視需要經取代之芳氧基、可視需要經取代之雜芳氧基、可視需

要經取代之雜環氧基、氰基、可視需要經取代之烯基、可視需要經取代之炔基、可視需要經取代之環烷基、可視需要經取代之環烯基、甲醯基、可視需要經取代之雜環基、可視需要經取代之烷硫基或 $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ ，其中 R^{13} 與 R^{14} 分別獨立為氫、可視需要經取代之烷基、可視需要經取代之芳基、可視需要經取代之雜芳基或可視需要經取代之雜環基； R^2 與 R^3 分別獨立為氫、鹵素、氰基、可視需要經取代之烷基、可視需要經取代之烷氧基、可視需要經取代之芳基或 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$ ，其中 R^{15} 與 R^{16} 分別獨立為氫、可視需要經取代之烷基、可視需要經取代之芳基、可視需要經取代之雜芳基或可視需要經取代之雜環基、或 R^2 與 R^3 共同為 $=\text{O}$ ，或 R^2 與 R^3 與其所附接之原子共同形成4、5、6或7員碳環系或雜環系環；各 R^4 分別獨立為鹵素、硝基、氰基、可視需要經取代之 C_{1-8} 烷基、可視需要經取代之 C_{2-6} 烯基、可視需要經取代之 C_{2-6} 炔基、可視需要經取代之烷氧羰基、可視需要經取代之烷羰基、可視需要經取代之烷胺羰基、可視需要經取代之二烷胺羰基、可視需要經取代之 C_{3-7} 環烷基、可視需要經取代之芳基、可視需要經取代之雜芳基、可視需要經取代之雜環基、可視需要經取代之烷氧基、可視需要經取代之芳氧基、可視需要經取代之雜芳氧基、可視需要經取代之烷硫基或 $\text{R}^{19}\text{R}^{20}\text{N}$ ，其中 R^{19} 與 R^{20} 分別獨立為氫、 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^{19} 與 R^{20} 與其所附接之氮原子共同形成5、6或7員雜環，其

中可另包含1或2個選自：O、N或S之雜原子，且其可視需要經1或2個C₁₋₆烷基取代，或2個相鄰R⁴與其相鄰碳原子共同形成4、5、6或7員碳環系或雜環系環，其可視需要經鹵素取代；n為0、1、2、3或4；R⁸為可視需要經取代之烷基、可視需要經取代之烯基、可視需要經取代之炔基、可視需要經取代之環烷基、可視需要經取代之芳基、可視需要經取代之烷氧基、可視需要經取代之芳氧基、可視需要經取代之烷氧羰基、可視需要經取代之烷羰基或可視需要經取代之烯羰基；R⁹與R¹⁰分別獨立為氫、鹵素、可視需要經取代之烷基、可視需要經取代之芳基或R⁹與R¹⁰共同形成-CH₂-、-CH=CH-或-CH₂CH₂-；或其鹽或N-氧化物。

另一種較佳化合物為彼等式(1B)化合物中，Y為單鍵、C=O或S(O)_q，其中q為0、1或2；R¹為氫、C₁₋₈烷基、C₁₋₆鹵烷基、C₁₋₆氰基烷基、C₃₋₇環烷基(C₁₋₆)烷基、C₅₋₆環烯基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷氧基(C₁₋₆)烷基、C₃₋₆烯氧基(C₁₋₆)烷基、C₃₋₆炔氧基(C₁₋₆)烷基、芳氧基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆羧烷基、C₁₋₆烷羰基(C₁₋₆)烷基、C₂₋₆烯羰基-(C₁₋₆)烷基、C₂₋₆炔羰基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷氧羰基(C₁₋₆)烷基、C₃₋₆烯氧羰基(C₁₋₆)烷基、C₃₋₆炔氧羰基(C₁₋₆)烷基、芳氧羰基(C₁₋₆)-烷基、C₁₋₆烷硫基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷亞磺醯基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷磺醯基(C₁₋₆)烷基、胺羰基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷胺羰基(C₁₋₆)烷基、二(C₁₋₆)-烷胺羰基(C₁₋₆)烷基、苯基(C₁₋₄)烷基(其中苯基可視需要經鹵素、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(C₁₋₄)烷基

(其中雜芳基可經鹵素、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(其中雜環基可經鹵素、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} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷羰基、胺羰基、 C_{1-6} 烷胺羰基、二(C_{1-6})烷胺羰基、苯基(可視需要經鹵素、 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)、雜芳基(可視需要經鹵素、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} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、芳氧基(其中芳基可視需要經鹵素、 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)、雜芳氧基(其中雜芳基可視需要經鹵素、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)、氰基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 鹵烯基、 C_{2-6} 氰烯基、胺羰基-(C_{2-6})烯基、 C_{1-6} 烷胺羰基(C_{2-6})烯基、二(C_{1-6})烷胺羰基(C_{2-6})烯基、苯基(C_{2-4})烯基(其中苯基可視需要經鹵素、 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)、 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_{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_{2-7})鹵環烷基、 C_{5-6} 環烯基、甲醯基、雜環基(可視需要經鹵素、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 $R^{13}R^{14}N$ ，其中 R^{13} 與 R^{14} 分別獨立為氫、COR⁴⁰

、C₁₋₆烷基、芳基(可視需要經鹵素、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(可視需要經鹵素或C₁₋₃烷基取代)、或R¹³與R¹⁴與其所附接之氮原子共同形成基團-N=C(R⁴¹)-NR⁴²R⁴³，其中R⁴¹、R⁴²與R⁴³分別獨立為H或C₁₋₄低碳數烷基；R²與R³分別獨立為氫、C₁₋₆烷基、C₁₋₆鹵烷基、C₁₋₆烷氧基或氰基；各R⁴分別獨立為鹵素、硝基、氰基、C₁₋₈烷基、C₁₋₆鹵烷基、C₁₋₆氰烷基、C₃₋₇環烷基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷氧基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷氧羰基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷羰基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷胺羰基(C₁₋₆)烷基、二(C₁₋₆)烷胺羰基(C₁₋₆)烷基、苯基(C₁₋₆)烷基(其中苯基可視需要經鹵素、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)、雜芳基(C₁₋₆)烷基(其中雜芳基可視需要經鹵素、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)、C₂₋₆烯基、C₂₋₆鹵烯基、C₂₋₆炔基、C₁₋₆烷氧羰基、C₁₋₆烷羰基、C₁₋₆烷胺羰基、二(C₁₋₆)烷胺羰基、C₃₋₇環烷基、苯基(可視需要經鹵素、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(可視需要鹵素、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)、C₁₋₈烷氧基、C₁₋₈鹵烷氧基、芳氧基(其中芳基可視需要經鹵素、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)或雜芳氧基(其中雜芳基可視需要經鹵素、C₁₋₄烷基、C₁₋₄

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)； n 為0、1、2、3或4； R^8 為 C_{1-10} 烷基，其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素、苯基(其本身可視需要經鹵素、 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(其本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代)、 C_{2-6} 烯基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代))、 C_{2-6} 炔基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 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))或 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ ，其中 z 為1或2， R^{51} 與 R^{52} 分別獨立為H、鹵素或 C_{1-2} 烷基， R^{53} 與 R^{54} 分別獨立為H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基且 R^{55} 為芳基(可視需要經鹵素、 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)或雜芳基(可視需要經鹵素、 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)； R^9 與 R^{10} 分別獨立為氫、 C_{1-2} 烷基或鹵素； R^{40} 為H、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、苯氧基(其中苯基可視需要經鹵素、 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)、苯基(可視

需要經鹵素、 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(可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代)、雜芳氧基(其中雜芳基可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代)或 $NR^{44}R^{45}$ ，其中 R^{44} 與 R^{45} 分別獨立為 C_{1-6} 烷基(可視需要經鹵素、硝基、氰基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)、苯基(可視需要經鹵素、 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)或雜芳基(可視需要經鹵素、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)及其鹽或N-氧化物。

另一種較佳化合物為彼等式(IC)化合物，其係式(I)中，Y為單鍵、C=O或 $S(O)_q$ ，其中q is 0、1或2； R^1 為氫、 C_{1-8} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 氰基烷基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-6})烷基、 C_{5-6} 環烯基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧基(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} 烷亞磺醯基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷磺醯基(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(其中苯基可視需要經鹵素、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)、雜芳基(C_{1-4})烷基(其中雜芳基可經鹵

素、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(其中雜環基可經鹵素、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} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷羰基、胺羰基、 C_{1-6} 烷胺羰基、二(C_{1-6})烷胺羰基、苯基(可視需要經鹵素、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)、雜芳基(可視需要經鹵素、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} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、芳氧基(其中芳基可視需要經鹵素、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(其中雜芳基可視需要經鹵素、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)、氰基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 鹵烯基、 C_{2-6} 氰烯基、胺羰基-(C_{2-6})烯基、 C_{1-6} 烷胺羰基(C_{2-6})烯基、二(C_{1-6})烷胺羰基(C_{2-6})烯基、苯基(C_{2-4})烯基(其中苯基可視需要經鹵素、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} 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_{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_{2-7})鹵環烷基、 C_{5-6} 環烯基、甲醯基、雜環基(可視需要經鹵素、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 $R^{13}R^{14}N$ ，其中 R^{13} 與 R^{14} 分別獨立為氫、 C_{1-6} 烷基、芳基(可視需要經鹵素、 C_{1-3} 烷基、硝基、氰基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)或雜芳基(可視需要經

鹵素或C₁₋₃烷基取代); R²與R³分別獨立為氫、C₁₋₆烷基、C₁₋₆鹵烷基、C₁₋₆烷氧基或氰基; 各R⁴分別獨立為鹵素、硝基、氰基、C₁₋₈烷基、C₁₋₆鹵烷基、C₁₋₆氰烷基、C₃₋₇環烷基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷氧基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷氧羰基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷羰基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷胺羰基(C₁₋₆)烷基、二(C₁₋₆)烷胺羰基(C₁₋₆)烷基、苯基(C₁₋₆)烷基(其中苯基可視需要經鹵素、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)、雜芳基(C₁₋₆)烷基(其中雜芳基可視需要經鹵素、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)、C₂₋₆烯基、C₂₋₆鹵烯基、C₂₋₆炔基、C₁₋₆烷氧羰基、C₁₋₆烷羰基、C₁₋₆烷胺羰基、二(C₁₋₆)烷胺羰基、C₃₋₇環烷基、苯基(可視需要經鹵素、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)、雜芳基(可視需要鹵素、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)、C₁₋₈烷氧基、C₁₋₈鹵烷氧基、芳氧基(其中芳基可視需要經鹵素、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)或雜芳氧基(其中雜芳基可視需要經鹵素、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); n為0、1、2、3或4; R⁸為C₁₋₁₀烷基(其可視需要經下列基團取代: C₁₋₆烷氧基、鹵素、苯基(其本身可視需要經鹵素、C₁₋₄烷基或C₁₋₄烷氧基取代))、C₂₋₆烯基(其可視需要經下列基團取代: C₁₋₆烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、C₁₋₄烷基或C₁₋₄烷氧基取代))或C₂₋₆炔基(其可視需要經下列基團取代: C₁₋₆烷氧基

、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代))； R^9 與 R^{10} 分別獨立為氫、 C_{1-2} 烷基或鹵素；及其鹽或N-氧化物。

另一種較佳化合物為彼等式(ID)化合物，其係式(I)中，Y為單鍵或 $C=O$ ； R^1 為氫、 C_{1-8} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 氟基烷基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-6})烷基、 C_{5-6} 環烯基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧基(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} 烷亞磺醯基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷磺醯基(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(其中苯基可視需要經鹵素、 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(其中雜芳基可經鹵素、硝基、氟基、 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(其中雜環基可經鹵素、氟基、 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} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷羰基、胺羰基、 C_{1-6} 烷胺羰基、二(C_{1-6})烷胺羰基、苯基(可視需要經鹵素、 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(可視需要經鹵素、硝基、氟基、 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} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、芳氧基(其中芳基可視需要經鹵素、 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(其中雜芳基可視需要經鹵素、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)、氰基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 鹵烯基、 C_{2-6} 氰烯基、胺羰基-(C_{2-6}) 烯基、 C_{1-6} 烷胺羰基(C_{2-6}) 烯基、二(C_{1-6}) 烷胺羰基(C_{2-6}) 烯基、苯基(C_{2-4}) 烯基(其中苯基可視需要經鹵素、 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、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_{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_{2-7}) 鹵環烷基、 C_{5-6} 環烯基、甲醯基、雜環基(可視需要經鹵素、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 $R^{13}R^{14}N$ ，其中 R^{13} 與 R^{14} 分別獨立為氫、 COR^{40} 、 C_{1-6} 烷基、芳基(可視需要經鹵素、 C_{1-3} 烷基、硝基、氰基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代)或雜芳基(可視需要經鹵素或 C_{1-3} 烷基取代)； R^2 與 R^3 分別獨立為氫或甲基，以均為氫較佳；各 R^4 分別獨立為鹵素、硝基、氰基、 C_{1-8} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 氰烷基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-6}) 烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6}) 烷基、 C_{1-6} 烷氧羰基(C_{1-6}) 烷基、 C_{1-6} 烷羰基(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_{1-6}) 烷基(其中苯基可視需要經鹵素、 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(其中雜芳基可視需要經鹵素、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、 C_{2-6} 鹵烯基、 C_{2-6} 炔基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷羰基、 C_{1-6} 烷胺羰基、二(C_{1-6})烷胺羰基、 C_{3-7} 環烷基、苯基(可視需要經鹵素、 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(可視需要鹵素、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_{1-8} 鹵烷氧基、芳氧基(其中芳基可視需要經鹵素、 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)或雜芳氧基(其中雜芳基可視需要經鹵素、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); n 為0、1、2、3或4; R^8 為 C_{1-10} 烷基，其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素、苯基(其本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代)、雜芳基(其本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代); 或 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ ，其中 z 為1或2， R^{51} 與 R^{52} 分別獨立為H、鹵素或 C_{1-2} 烷基， R^{53} 與 R^{54} 分別獨立為H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基且 R^{55} 為芳基(可視需要經鹵素、 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)或雜芳基(可視需要經鹵素、 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)； R^9 與 R^{10} 均為氫； R^{40} 為H、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、苯氧基(其中苯基可視需要經鹵素、 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)、苯基(可視需要經鹵素、 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(可視需要經鹵素、 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)或雜芳氧基(可視需要經鹵素、 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)及其鹽或N-氧化物。

另一種較佳化合物為彼等式(IE)化合物，其係式(I)化合物中，Y、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 與n如式IC之定義； R^9 與 R^{10} 分別獨立為氫、 C_{1-2} 烷基或鹵素，以均為氫較佳；及其鹽或N-氧化物。

另一種較佳化合物為彼等式(IF)化合物，其係式(I)化合物中，Y、 R^1 、 R^4 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 與n如式(IE)之定義； R^2 與 R^3 分別獨立為氫、鹵素、 C_{1-2} 烷基、 C_{1-2} 鹵烷基、 C_{1-2} 烷氧基、氧基，或 R^2 與 R^3 共同為=O，或 R^2 與 R^3 與其所附接之原子共同形成4、5、6或7員碳環系或雜環系雜環；及其鹽或N-氧化物。

另一種較佳化合物為彼等式(IG)化合物，其係式(I)化合物中，Y、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 與n如式(IF)之定義；

各 R^4 分別獨立為鹵素、硝基、氰基、 C_{1-8} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 氰基烷基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧羰基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷羰基(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_{1-6})烷基(其中苯基可視需要經鹵素、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN或 NO_2 取代)、雜芳基(C_{1-6})烷基(其中雜芳基可視需要經鹵素、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、 C_{2-6} 鹵烯基、 C_{2-6} 炔基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷羰基、 C_{1-6} 烷胺羰基、二(C_{1-6})烷胺羰基、 C_{3-7} 環烷基、苯基(可視需要經鹵素、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN或 NO_2 取代)、雜芳基(可視需要經鹵素、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_{1-8} 鹵烷氧基、芳氧基(其中芳基可視需要經鹵素、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN或 NO_2 取代)或雜芳氧基(其中雜芳基可視需要經鹵素、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)；或其鹽或N-氧化物。

另一種較佳化合物為彼等式(IG')化合物，其係式(I)化合物中， Y 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 與 n 如式(II)之定義；各 R^4 分別獨立為鹵素、硝基、氰基、 C_{1-8} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 氰基烷基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧羰基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷羰基(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_{1-6})

烷基(其中苯基可視需要經鹵素、 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(其中雜芳基可視需要經鹵素、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、 C_{2-6} 鹵烯基、 C_{2-6} 炔基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷羰基、 C_{1-6} 烷胺羰基、二(C_{1-6})烷胺羰基、 C_{3-7} 環烷基、苯基(可視需要經鹵素、 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(可視需要經鹵素、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_{1-8} 鹵烷氧基、苯氧基(其中苯基可視需要經鹵素、 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)或雜芳氧基(其中雜芳基可視需要經鹵素、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);或其鹽或N-氧化物。

另一種較佳化合物為彼等式(IH)化合物，其係式(I)化合物中， R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 與n如式(IG)之定義，Y為單鍵或C=O； R^1 為 C_{1-8} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 氰基烷基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-6})烷基、 C_{5-6} 環烯基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧基(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(C₁₋₆)-烷基、C₁₋₆烷硫基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷亞磺醯基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷磺醯基(C₁₋₆)烷基、胺羰基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷胺羰基(C₁₋₆)烷基、二(C₁₋₆)-烷胺羰基(C₁₋₆)烷基、苯基(C₁₋₄)烷基(其中苯基可視需要經鹵素、C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆鹵烷基、C₁₋₄鹵烷氧基、CN或NO₂取代)、雜芳基(C₁₋₄)烷基(其中雜芳基可經鹵素、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)、雜環基(C₁₋₄)烷基(其中雜環基可經鹵素、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烷氧羰基、C₁₋₆烷羰基、胺羰基、C₁₋₆烷胺羰基、二(C₁₋₆)烷胺羰基、苯基(可視需要經鹵素、C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆鹵烷基、C₁₋₄鹵烷氧基、CN或NO₂取代)、雜芳基(可視需要經鹵素、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烷氧基、C₁₋₆鹵烷氧基、芳氧基(其中芳基可視需要經鹵素、C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆鹵烷基、C₁₋₄鹵烷氧基、CN或NO₂取代)、氰基、C₂₋₆烯基、C₂₋₆鹵烯基、C₂₋₆氰烯基、胺羰基-(C₂₋₆)烯基、C₁₋₆烷胺羰基(C₂₋₆)烯基、二(C₁₋₆)烷胺羰基(C₂₋₆)烯基、苯基(C₂₋₄)烯基(其中苯基可視需要經鹵素、C₁₋₆烷基、C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆鹵烷基、C₁₋₄鹵烷氧基、CN或NO₂取代)、C₂₋₆炔基、胺羰基(C₂₋₆)-炔基、烷胺羰基(C₂₋₆)-炔基、二(C₁₋₆)烷胺羰基(C₂₋₆)炔基、C₃₋₇環烷基、C₃₋₇鹵環烷基、C₃₋₇氰基環烷基、C₁₋₃烷基(C₃₋₇)環烷基、C₁₋₃烷基-(C₃₋₇)鹵環烷基、C₅₋₆環烯基、甲醯基、雜環基(可視需要經鹵素、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

)、 C_{1-8} 烷硫基、或 $R^{13}R^{14}N$ ，其中 R^{13} 與 R^{14} 分別獨立為氫、 C_{1-6} 烷基、芳基(可視需要經鹵素、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN或 NO_2 取代)或雜芳基(可視需要經鹵素或 C_{1-3} 烷基取代)；及其鹽或N-氧化物。

另一種較佳化合物為彼等式(IH')化合物，其係式(I)化合物中， R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 與n如式(IG')之定義， R^1 為 C_{1-8} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 氰基烷基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-6})烷基、 C_{5-6} 環烯基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧基(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} 烷亞磺醯基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷磺醯基(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(其中苯基可視需要經鹵素、 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(其中雜芳基可經鹵素、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(其中雜環基可經鹵素、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} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷羰基、胺羰基、 C_{1-6} 烷胺羰基、二(C_{1-6})烷胺羰基、苯基(可視需要經鹵素、 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(可視需要經鹵素、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} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、芳氧基(其中芳基可視需要經鹵素、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)、氰基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 鹵烯基、 C_{2-6} 氰烯基、胺羰基-(C_{2-6})烯基、 C_{1-6} 烷胺羰基(C_{2-6})烯基、二(C_{1-6})烷胺羰基(C_{2-6})烯基、苯基(C_{2-4})烯基(其中苯基可視需要經鹵素、 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、胺羰基(C_{2-6})-炔基、烷胺羰基(C_{2-6})-炔基、二(C_{1-6})烷胺羰基(C_{2-6})炔基、 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、 C_{5-6} 環烯基、甲醯基、雜環基(可視需要經鹵素、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 $R^{13}R^{14}N$ ，其中 R^{13} 與 R^{14} 分別獨立為氫、 C_{1-6} 烷基、 COR^{40} 、 C_{1-6} 烷胺基、苯氧胺基(其中苯基可視需要經鹵素、 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、苯胺基(其中苯基可視需要經鹵素、 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)；及其鹽或N-氧化物。

另一種較佳化合物為彼等式(IJ)化合物，其係式(I)化合物中，Y、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^9 、 R^{10} 與n如式(IH)之定義； R^8 為 C_{1-10} 烷基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵

素或苯基(本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代))、 C_{2-6} 烯基(可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代))或 C_{2-6} 炔基(可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代))；及其鹽或N-氧化物。

另一種較佳化合物為彼等式(IJ')化合物，其係式(I)化合物中， Y 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^9 、 R^{10} 與 n 如式(IH')之定義； R^8 為 C_{1-6} 烷基(其可視需要經苯基或雜芳基取代(苯基與雜芳基可視需要經鹵素、 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)；或 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ ，其中 z 為1或2， R^{51} 與 R^{52} 分別獨立為H、鹵素或 C_{1-2} 烷基， R^{53} 與 R^{54} 分別獨立為H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基且 R^{55} 為芳基(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)或雜芳基(可視需要經鹵素、 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)。

另一種較佳化合物為彼等式(IK)化合物，其係式(I)中， Y 為單鍵、 $C=O$ 或 $S(O)_q$ ，其中 q 為0、1或2； R^1 為 C_{1-8} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 氰基烷基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧基(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

(C₁₋₆)烷基、C₃₋₆烯氧羰基(C₁₋₆)烷基、C₃₋₆炔氧羰基(C₁₋₆)烷基、芳氧羰基(C₁₋₆)-烷基、C₁₋₆ 烷硫基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷亞磺醯基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷磺醯基(C₁₋₆)烷基、胺羰基(C₁₋₆)烷基、C₁₋₆烷胺羰基(C₁₋₆)烷基、二(C₁₋₆)-烷胺羰基(C₁₋₆)烷基、苯基(C₁₋₄)烷基(其中苯基可視需要經鹵素、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)、雜芳基(C₁₋₄)烷基(其中雜芳基可經鹵素、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)、雜環基(C₁₋₄)烷基(其中雜環基可經鹵素、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)、苯基(可視需要經鹵素、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)、雜芳基(可視需要經鹵素、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烷氧基、C₁₋₆鹵烷氧基、C₂₋₆烯基、C₂₋₆鹵烯基、C₂₋₆氰烯基、C₂₋₆炔基、C₃₋₇環烷基、甲醯基、雜環基(可視需要經鹵素、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)或C₁₋₆烷硫基；R²與R³分別獨立為氫或C₁₋₄烷基；各R⁴分別獨立為鹵素、氰基、C₁₋₁₀烷基(其可視需要經下列基團取代：C₁₋₆烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、C₁₋₄烷基或C₁₋₄烷氧基取代))、C₂₋₆烯基(其可視需要經下列基團取代：C₁₋₆烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、C₁₋₄烷基或C₁₋₄烷氧基取代))或C₂₋₆炔基(其可視需要經下列基團取代：C₁₋₆烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、C₁₋₄烷基或C₁₋₄烷氧基取代))；n為0

、1、2、3或4； R^8 為 C_{1-10} 烷基，其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素、苯基(其本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代)、 C_{2-6} 烯基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代))或 C_{2-6} 炔基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代))； R^9 與 R^{10} 均為氫；及其鹽或N-氧化物。

另一種較佳化合物為彼等式(II)化合物，其係式(I)中，Y為單鍵或C=O； R^1 為 C_{1-8} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 氰基烷基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧基(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} 烷亞磺醯基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷磺醯基(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(其中苯基可視需要經鹵素、 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(其中雜芳基可經鹵素、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(其中雜環基可經鹵素、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)、苯基

(可視需要經鹵素、 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(可視需要經鹵素、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} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 鹵烯基、 C_{2-6} 氰烯基、 C_{2-6} 炔基、 C_{3-7} 環烷基、甲醯基、雜環基(可視需要經鹵素、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 C_{1-6} 烷硫基、 C_{1-6} 烷羰胺基、苯氧羰胺基(其中苯基可視需要經鹵素、 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、苯胺基(其中苯基可視需要經鹵素、 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)； R^2 與 R^3 分別獨立為氫或 C_{1-4} 烷基；各 R^4 分別獨立為鹵素、氰基、 C_{1-10} 烷基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 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} 烯基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 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))或 C_{2-6} 炔基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 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))； n 為0、1、2、3

或4； R^8 為 C_{1-10} 烷基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 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} 烯基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 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))或 C_{2-6} 炔基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 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))；或 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ ，其中 z 為1或2， R^{51} 與 R^{52} 分別獨立為H、鹵素或 C_{1-2} 烷基， R^{53} 與 R^{54} 分別獨立為H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基且 R^{55} 為苯基(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)或雜芳基(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)； R^{40} 為H、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、苯氧基(其中苯基可視需要經鹵素、 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)、苯基(可視需要經鹵素、 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(可視需要經鹵素、 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)或雜芳氧基(可視需要經鹵素、 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); R^9 與 R^{10} 均為氫或甲基; 及其鹽或N-氧化物。

另一種較佳化合物為彼等式(IM)化合物, 其係式(I)中, Y為單鍵或C=O; R^1 為 C_{1-8} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 氰基烷基、 C_{3-7} 環烷基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷氧基(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} 烷亞磺醯基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷磺醯基(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(其中苯基可視需要經鹵素、 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(其中雜芳基可經鹵素、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(其中雜環基可經鹵素、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)、苯基(可視需要經鹵素、 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(可視需要經鹵素、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} 烷氧基、 C_{1-6}

鹵烷氧基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 鹵烯基、 C_{2-6} 氰烯基、 C_{2-6} 炔基、 C_{3-7} 環烷基、甲醯基、雜環基(可視需要經鹵素、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 C_{1-6} 烷硫基、 C_{1-6} 烷羰胺基、苯氧羰胺基(其中苯基可視需要經鹵素、 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、苯胺基(其中苯基可視需要經鹵素、 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)； R^2 與 R^3 分別獨立為氫或甲基，以均為氫較佳；各 R^4 分別獨立為鹵素、氰基、 C_{1-10} 烷基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 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} 烯基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 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))或 C_{2-6} 炔基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 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))； n 為0、1、2、3或4； R^8 為苯基(C_{1-4})烷基(其中苯基可視需要經鹵素、 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(其中雜芳基可視需要經鹵素、 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))；或 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ ，其中 z 為 1 或 2， z 為 1 更佳； R^{51} 與 R^{52} 分別獨立為 H、鹵素或 C_{1-2} 烷基， R^{53} 與 R^{54} 分別獨立為 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基且 R^{55} 為苯基(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)或雜芳基(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)； R^{40} 為 H、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、苯氧基(其中苯基可視需要經鹵素、 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)、苯基(可視需要經鹵素、 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(可視需要經鹵素、 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)或雜芳氧基(可視需要經鹵素、 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)；及其鹽或 N-氧化物。

較佳為其中 Y 為單鍵、 $C=O$ 、 $C=S$ 或 $S(O)_q$ ，其中 q 為 0、1 或 2。

更佳為其中 Y 為單鍵、 $C=O$ 或 SO_2 。

最佳為其中 Y 為單鍵或 $C=O$ ，尤指 $C=O$ 。

R^1 較佳為氫、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 氟基烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{3-7}

環烷基(C₁₋₄)烷基、C₁₋₆烷氧基(C₁₋₆)烷基、雜芳基(C₁₋₆)烷基(其中雜芳基可經鹵素、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，或雜芳基系上兩個相鄰位置可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環(其本身可視需要經鹵素取代))、芳基(C₁₋₆)烷基(其中芳基可視需要經鹵素、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，或芳基系上兩個相鄰位置可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環(其本身可視需要經鹵素取代))、C₁₋₆烷羰胺基(C₁₋₆)烷基、芳基(其可視需要經鹵素、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，或芳基系上兩個相鄰位置可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環(其本身可視需要經鹵素取代))、雜芳基(其可視需要經鹵素、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，或雜芳基系上兩個相鄰位置可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環(其本身可視需要經鹵素取代))、C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆鹵烷氧基、苯氧基(其中苯基可視需要經鹵素、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(可視需

要經鹵素、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(可視需要經鹵素、 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(可視需要經鹵素、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} 與 R^{14} 分別獨立為氫、 C_{2-6} 烷基、 C_{2-6} 鹵烷基、苯基(其可視需要經鹵素、 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、二烷胺基或 C_{1-4} 烷氧羰基取代)或雜芳基(其可視需要經鹵素、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、 C_{1-4} 烷氧羰基、 C_{1-6} 烷羰胺基、苯氧羰胺基(其中苯基可視需要經鹵素、 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(其中苯基可視需要經鹵素、 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)。

更佳為其中 R^1 為氫、 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_{1-6})烷基(其中雜芳基可經鹵素、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，或雜芳基系上兩個相鄰位置可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環(其本身可視需要經鹵素取代))、苯基(C_{1-6})烷基(其中苯基可視需要經鹵素

、 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，或苯基環上兩個相鄰位置可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環(其本身可視需要經鹵素取代))、 C_{1-6} 烷羰胺基(C_{1-6})烷基、苯基(其可視需要經鹵素、 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，或苯基環上兩個相鄰位置可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環(其本身可視需要經鹵素取代))、雜芳基(其可視需要經鹵素、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，或雜芳基系上兩個相鄰位置可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環(其本身可視需要經鹵素取代))、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、苯氧基(其中苯基可視需要經鹵素、 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(可視需要經鹵素、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(可視需要經鹵素、 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_{3-6} 環烷基、 C_{5-7} 環烯基、雜環基(可視需要經鹵素、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} 與 R^{14} 分別獨立為氫、 COR^{40} 、 C_{2-6} 烷基、 C_{2-6} 鹵烷基、苯基(其可視需要經鹵素、 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、二烷胺基或 C_{1-4} 烷氧羰基取代)或雜芳基(其可視需要經鹵素、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_{1-4} 烷氧羰基取代)； C_{1-6} 烷羰胺基、苯氧羰胺基(其中苯基可視需要經鹵素、 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(其中苯基可視需要經鹵素、 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)。

甚至更佳為其中 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經鹵素、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，或雜芳基系上兩個相鄰位置可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環(其本身可視需要經鹵素取代))、苯基(C_{1-3})烷基(其中苯基可視需要經鹵素、 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、二烷胺基、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 烷氧羰基取代，或苯基環上兩個相鄰位置可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環(其本身可視需要經鹵素取代))、苯基(其可視需要經鹵素、 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、二烷胺基、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 烷氧羰基取代，或苯基環上兩個相鄰位置可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環(其本身可視需要經鹵素取代))、雜芳基(其可視需要經鹵素、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，或雜芳基系上兩個相鄰位置可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環(其本身可視需要經鹵素取代))、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{2-6} 烯基、雜環基(可視需要經鹵素、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} 與 R^{14} 分別獨立為氫、 C_{2-6} 烷基或 C_{2-6} 鹵烷基、 C_{2-6} 烷羰基或苯羰基(其中苯基可視需要經鹵素、 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)。

亦更佳為其中 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經鹵素、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基取代)(其中雜芳基為吡啶、嘧啶、吡嘞或嗒嘞環)、雜芳基(可視需要經鹵素、氰基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基取代)(其中雜芳基為吡啶、嘧啶、吡嘞或嗒嘞環)、 C_{1-6} 烷氧基或雜環基(可視需要經鹵素、氰基、 C_{1-3} 烷基、 C_{1-3} 鹵烷基或 C_{1-3} 烷氧基取代)。

最佳為其中 R^1 為吡啶基(可視需要經鹵素、 C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 鹵烷基取代)或 C_{1-6} 烷氧基，尤指經鹵素取代之吡啶。

較佳為 R^2 與 R^3 分別獨立為氫或 C_{1-4} 烷基。

更佳為 R^2 與 R^3 分別獨立為氫或甲基。

甚至更佳為 R^2 為氫且 R^3 為氫或甲基。

最佳為 R^2 與 R^3 均為氫。

較佳為各 R^4 分別獨立為鹵素、氰基、 C_{1-8} 烷基、 C_{1-8} 鹵烷基、 C_{1-6} 氰烷基、 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} 烷亞磺醯基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷磺醯基(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(其中苯基可視需要經鹵素、 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(其中雜芳基可視需要經鹵素、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(其中雜環基可視需要經鹵素、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、胺羰基(C_{2-6})烯基、 C_{1-6} 烷胺羰基(C_{2-6})烯基、二(C_{1-6})烷胺羰基(C_{2-6})烯基、苯基(C_{2-4})-烯基(其中苯基可視需要經鹵素、 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(C₁₋₆)烷胺羰基(C₂₋₆)炔基、C₁₋₆烷氧羰基、C₃₋₇環烷基、C₃₋₇鹵環烷基、C₃₋₇氰環烷基、C₁₋₃烷基(C₃₋₇)-環烷基、C₁₋₃烷基(C₃₋₇)鹵環烷基、苯基(可視需要經鹵素、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(可視需要經鹵素、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)、雜環基(其中雜環基可視需要經鹵素、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)，或2個相鄰基團R⁴與其相鄰碳原子共同形成4、5、6或7員碳環系或雜環系環，其可視需要經下列基團取代：鹵素、C₁₋₈烷氧基、C₁₋₆鹵烷氧基、苯氧基(可視需要經鹵素、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)、雜芳氧基(可視需要經鹵素、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)、C₁₋₈烷硫基或R¹⁹R²⁰N，其中R¹⁹與R²⁰分別獨立為氫、C₁₋₈烷基、C₃₋₇環烷基、C₃₋₆烯基、C₃₋₆炔基、C₂₋₆鹵烷基、C₁₋₆烷氧羰基或R¹⁹與R²⁰其所附接之氮原子共同形成5、6或7員雜環系環，其中可另包含1或2個選自：O、N或S之雜原子且可視需要經1或2個C₁₋₆烷基取代；n為0、1、2、3或4。

更佳為各R⁴分別獨立為鹵素、氰基、C₁₋₈烷基、C₁₋₈鹵烷基、C₁₋₈氰烷基、C₁₋₆烷氧基(C₁₋₆)烷基、C₂₋₆炔基、三甲矽烷基(C₂₋₆)炔基、C₁₋₆烷氧羰基、C₃₋₇環烷基、C₁₋₃烷基(C₃₋₇)-環烷基、苯基(可視需要經鹵素、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)、雜環基(其可視需要經鹵素、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(可視需要經鹵素、 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(可視需要經鹵素、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個相鄰基團 R^4 與其相鄰碳原子共同形成4、5、6或7員碳環系或雜環系環，其可視需要經鹵素取代；n為0、1、2、3或4。

甚至更佳為各 R^4 分別獨立為鹵素、氰基、 C_{1-8} 烷基、 C_{1-8} 鹵烷基、 C_{1-8} 氟烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、 C_{2-6} 炔基、雜環基(其可視需要經 C_{1-6} 烷基取代)、 C_{1-8} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、苯氧基(可視需要經鹵素、氰基、 C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 鹵烷基取代)、雜芳氧基(可視需要經鹵素、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個相鄰基團 R^4 與其相鄰碳原子共同形成4、5、6或7員碳環系或雜環系環，其可視需要經鹵素取代；n為0、1、2、3或4。

亦更佳為各 R^4 分別獨立為氟、氯、溴、氰基、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 氟烷基或 C_{1-3} 烷氧基(C_{1-3})烷基；n為0、1或2。

最佳為各 R^4 分別獨立為氟、氯、溴、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基；n為1或2。

較佳為 R^8 為 C_{1-10} 烷基、 C_{1-10} 鹵烷基、芳基(C_{1-6})烷基(其中芳基可視需要經鹵素、 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)、雜芳基(C_{1-6})烷基(其中雜芳基可視需要經鹵素、 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)、芳羰基-(C_{1-6})烷基(其中芳基可視需要經鹵素、 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且烷基可視需要經芳基取代)、 C_{2-8} 烯基、 C_{2-8} 鹵烯基、芳基(C_{2-6})-烯基(其中芳基可視需要經鹵素、 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、 C_{1-6} 烷氧羰基取代，或兩個相鄰取代基可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環)、 C_{2-6} 炔基、苯基(C_{2-6})炔基(其中苯基可視需要經鹵素、 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)、 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 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ ，其中 z 為1或2， R^{51} 與 R^{52} 分別獨立為H、鹵素或 C_{1-2} 烷基， R^{53} 與 R^{54} 分別獨立為H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基，且 R^{55} 為可視需要經取代之芳基或可視需要經取代之雜芳基。

R^8 更佳為 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、芳基(C_{1-4})烷基(其中芳基可視需要經鹵素、 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)、雜芳基(C₁₋₆)烷基(其中雜芳基可視需要經鹵素、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)、C₂₋₆烯基、芳基(C₂₋₆)-烯基(其中芳基可視需要經鹵素、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)、C₂₋₆炔基、苯基(C₂₋₆)炔基(其中苯基可視需要經鹵素、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 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$, 其中 z 為 1 或 2, R⁵¹ 與 R⁵² 分別獨立為 H、鹵素或 C₁₋₂ 烷基, R⁵³ 與 R⁵⁴ 分別獨立為 H、鹵素、C₁₋₄ 烷基或 C₁₋₄ 鹵烷基, 且 R⁵⁵ 為可視需要經取代之芳基或可視需要經取代之雜芳基。

甚至更佳為 R⁸ 為苯基(C₁₋₄)烷基(其中苯基可視需要經鹵素、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(其中雜芳基可視需要經鹵素、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(其中苯基可視需要經鹵素、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(其中苯基可視需要經鹵素、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 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$, 其中 z 為 1 或 2, R⁵¹ 與 R⁵² 分別獨立為 H、鹵素或 C₁₋₂ 烷基,

R^{53} 與 R^{54} 分別獨立為H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基，且 R^{55} 為可視需要經取代之芳基或可視需要經取代之雜芳基。

甚至更佳為 R^8 為苯基 CH_2 - (其中苯基可視需要經鹵素、 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 CH_2 - (其中雜芳基為可視需要經鹵素、 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雙環基)，或 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ ，其中 z 為1或2， R^{51} 與 R^{52} 分別獨立為H、鹵素或 C_{1-2} 烷基， R^{53} 與 R^{54} 分別獨立為H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基，且 R^{55} 為可視需要經取代之芳基或可視需要經取代之雜芳基。

亦更佳為 R^8 為苯基(C_{2-4})烯基(其中苯基可視需要經鹵素、硝基、氰基、 C_{1-3} 烷基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{1-3} 烷氧基、 C_{1-3} 烷氧羰基或 C_{1-3} 鹵烷氧基取代)或苯基(C_{2-4})炔基(其中苯基可視需要經鹵素、硝基、氰基、 C_{1-3} 烷基、 C_{1-3} 鹵烷基、 C_{1-3} 烷氧基、 C_{1-3} 烷氧羰基或 C_{1-3} 鹵烷氧基取代)；或 R^8 為 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ ，其中 z 為1或2， R^{51} 與 R^{52} 分別獨立為H、鹵素或 C_{1-2} 烷基， R^{53} 與 R^{54} 分別獨立為H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基，且 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。

最佳為 R^8 為 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ ，其中 z 為1或2

， R^{51} 與 R^{52} 分別獨立為H、鹵素或 C_{1-2} 烷基， R^{53} 與 R^{54} 分別獨立為H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基，且 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。

較佳為 R^9 與 R^{10} 均為氫。

R^{51} 與 R^{52} 均為氫較佳。

R^{53} 與 R^{54} 為氫或鹵素較佳，尤指氫。

R^{55} 為經1-3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、胺基或二烷胺基之取代基取代之苯基較佳。

某些式(I)化合物為新穎者，且形成本發明另一方面。例如：提供如上述定義之新穎式(IK)化合物及其鹽或N-氧化物，但其限制條件為 R^8 不為甲基且 YR^1 不為 SO_2CH_3 、甲基、乙基、苯基或經氟取代之苯基。

其他新穎化合物為彼等式IN化合物，其係式I中，Y為單鍵或C=O； 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且雜芳基為吡啶、嘧啶、吡嘧或嗒嘧環)、雜芳基(可視需要經鹵素、 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且其中雜芳基為吡啶、嘧啶、吡嘧或嗒嘧環)、 C_{1-6}

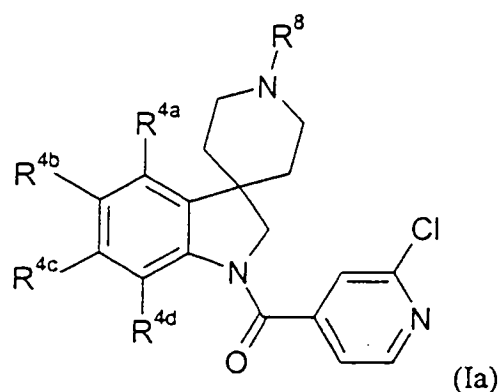
烷氧基或雜環基(可視需要經鹵素、氟基、 C_{1-3} 烷基、 C_{1-3} 鹵烷基或 C_{1-3} 烷氧基取代); R^4 分別獨立為氟、氯、溴、氟基、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 氟烷基或 C_{1-3} 烷氧基(C_{1-3})烷基; n 為0、1或2; R^8 為苯基(C_{2-4})烯基(其中苯基可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基、二烷胺基或 C_{1-3} 烷氧羰基取代)或苯基(C_{2-4})炔基(其中苯基可視需要經鹵素、 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、二烷胺基或 C_{1-3} 烷氧羰基取代)且 R^2 、 R^3 、 R^9 與 R^{10} 均為氫。

其他新穎化合物為彼等式IP化合物，其係式I中，Y為C(O); R^1 為吡啶基(可視需要經鹵素、 C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 鹵烷基取代)或 C_{1-6} 烷氧基; R^2 、 R^3 、 R^9 與 R^{10} 均為氫; R^4 為氟、氯、溴、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基; n 為1或2; R^8 為苯基 CH_2- (其中苯基可視需要經鹵素、 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 CH_2- (其中雜芳基為可視需要經鹵素、硝基、氟基、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 鹵烷氧基取代之雙環基)，或 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]z-R^{55}$ ，其中 z 為1或2， R^{51} 與 R^{52} 分別獨立為H、鹵素或 C_{1-2} 烷基， R^{53} 與 R^{54} 分別獨立為H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基，且 R^{55} 為可視需要經取代之芳基或可視需要經取代之雜芳基，但其限制條件為a)當 R^4 為5-氟且 R^1 為2,6-二氯吡啶-4-基時，則 R^8 不為4-甲基苯甲基、3-甲基苯甲基、4-三氟甲氧苯甲基、4-三

氟甲基苯甲基、4-氟基苯甲基、4-甲巰基苯甲基或肉桂基，及b)當 R^{4n} 為5-氟且 R^1 為2-氟吡啶-4-基時，則 R^8 不為3-氟苯甲基、3,5-二氟苯甲基、4-三氟甲氧基苯甲基、4-三氟甲基苯甲基、4-氟基苯甲基或4-甲巰基苯甲基。

下表I至XXXII說明本發明化合物。

表I提供301種式Ia化合物



其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表I。

表 I

化合物	R^8	R^{4a}	R^{4b}	R^{4c}	R^{4d}
I-1	肉桂基	H	H	H	H
I-2	4-氟肉桂基	H	H	H	H
I-3	4-氟桂基	H	H	H	H
I-4	4-硝基肉桂基	H	H	H	H
I-5	4-甲氧基肉桂基	H	H	H	H
I-6	4-甲基肉桂基	H	H	H	H
I-7	4-三氟甲基肉桂基	H	H	H	H
I-8	4-氟基肉桂基	H	H	H	H
I-9	2,4-二氟肉桂基	H	H	H	H
I-10	2,4-二氟肉桂基	H	H	H	H

I-11	肉桂基	Cl	H	H	H
I-12	4-氯肉桂基	Cl	H	H	H
I-13	4-氟桂基	Cl	H	H	H
I-14	4-硝基肉桂基	Cl	H	H	H
I-15	4-甲氧基肉桂基	Cl	H	H	H
I-16	4-甲基肉桂基	Cl	H	H	H
I-17	4-三氟甲基肉桂基	Cl	H	H	H
I-18	4-氟基肉桂基	Cl	H	H	H
I-19	2,4-二氯肉桂基	Cl	H	H	H
I-20	2,4-二氟肉桂基	Cl	H	H	H
I-21	肉桂基	H	Cl	H	H
I-22	4-氯肉桂基	H	Cl	H	H
I-23	4-氟桂基	H	Cl	H	H
I-24	4-硝基肉桂基	H	Cl	H	H
I-25	4-甲氧基肉桂基	H	Cl	H	H
I-26	4-甲基肉桂基	H	Cl	H	H
I-27	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	H	H
I-28	4-氟基肉桂基	H	Cl	H	H
I-29	2,4-二氯肉桂基	H	Cl	H	H
I-30	2,4-二氟肉桂基	H	Cl	H	H
I-31	肉桂基	H	H	Cl	H
I-32	4-氯肉桂基	H	H	Cl	H
I-33	4-氟桂基	H	H	Cl	H

I-34	4-硝基肉桂基	H	H	Cl	H
I-35	4-甲氧基肉桂基	H	H	Cl	H
I-36	4-甲基肉桂基	H	H	Cl	H
I-37	4-三氟甲基肉桂基	H	H	Cl	H
I-38	4-氟基肉桂基	H	H	Cl	H
I-39	2,4-二氟肉桂基	H	H	Cl	H
I-40	2,4-二氟肉桂基	H	H	Cl	H
I-41	肉桂基	H	H	H	Cl
I-42	4-氟肉桂基	H	H	H	Cl
I-43	4-氟桂基	H	H	H	Cl
I-44	4-硝基肉桂基	H	H	H	Cl
I-45	4-甲氧基肉桂基	H	H	H	Cl
I-46	4-甲基肉桂基	H	H	H	Cl
I-47	4-三氟甲基肉桂基	H	H	H	Cl
I-48	4-氟基肉桂基	H	H	H	Cl
I-49	2,4-二氟肉桂基	H	H	H	Cl
I-50	2,4-二氟肉桂基	H	H	H	Cl
I-51	肉桂基	F	H	H	H
I-52	4-氟肉桂基	F	H	H	H
I-53	4-氟桂基	F	H	H	H
I-54	4-硝基肉桂基	F	H	H	H
I-55	4-甲氧基肉桂基	F	H	H	H
I-56	4-甲基肉桂基	F	H	H	H

I-57	4-三氟甲基肉桂基	F	H	H	H
I-58	4-氟基肉桂基	F	H	H	H
I-59	2,4-二氟肉桂基	F	H	H	H
I-60	2,4-二氟肉桂基	F	H	H	H
I-61	肉桂基	H	F	H	H
I-62	4-氟肉桂基	H	F	H	H
I-63	4-氟桂基	H	F	H	H
I-64	4-硝基肉桂基	H	F	H	H
I-65	4-甲氧基肉桂基	H	F	H	H
I-66	4-甲基肉桂基	H	F	H	H
I-67	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	H
I-68	4-氟基肉桂基	H	F	H	H
I-69	2,4-二氟肉桂基	H	F	H	H
I-70	2,4-二氟肉桂基	H	F	H	H
I-71	肉桂基	H	H	F	H
I-72	4-氟肉桂基	H	H	F	H
I-73	4-氟桂基	H	H	F	H
I-74	4-硝基肉桂基	H	H	F	H
I-75	4-甲氧基肉桂基	H	H	F	H
I-76	4-甲基肉桂基	H	H	F	H
I-77	4-三氟甲基肉桂基	H	H	F	H
I-78	4-氟基肉桂基	H	H	F	H
I-79	2,4-二氟肉桂基	H	H	F	H

I-80	2,4-二氟肉桂基	H	H	F	H
I-81	肉桂基	H	H	H	F
I-82	4-氟肉桂基	H	H	H	F
I-83	4-氟桂基	H	H	H	F
I-84	4-硝基肉桂基	H	H	H	F
I-85	4-甲氧基肉桂基	H	H	H	F
I-86	4-甲基肉桂基	H	H	H	F
I-87	4-三氟甲基肉桂基	H	H	H	F
I-88	4-氟基肉桂基	H	H	H	F
I-89	2,4-二氟肉桂基	H	H	H	F
I-90	2,4-二氟肉桂基	H	H	H	F
I-91	肉桂基	Br	H	H	H
I-92	4-氟肉桂基	Br	H	H	H
I-93	4-氟桂基	Br	H	H	H
I-94	4-硝基肉桂基	Br	H	H	H
I-95	4-甲氧基肉桂基	Br	H	H	H
I-96	4-甲基肉桂基	Br	H	H	H
I-97	4-三氟甲基肉桂基	Br	H	H	H
I-98	4-氟基肉桂基	Br	H	H	H
I-99	2,4-二氟肉桂基	Br	H	H	H
I-100	2,4-二氟肉桂基	Br	H	H	H
I-101	肉桂基	H	Br	H	H
I-102	4-氟肉桂基	H	Br	H	H

I-103	4-氟桂基	H	Br	H	H
I-104	4-硝基肉桂基	H	Br	H	H
I-105	4-甲氧基肉桂基	H	Br	H	H
I-106	4-甲基肉桂基	H	Br	H	H
I-107	4-三氟甲基肉桂基	H	Br	H	H
I-108	4-氟基肉桂基	H	Br	H	H
I-109	2,4-二氟肉桂基	H	Br	H	H
I-110	2,4-二氟肉桂基	H	Br	H	H
I-111	肉桂基	H	H	Br	H
I-112	4-氟肉桂基	H	H	Br	H
I-113	4-氟桂基	H	H	Br	H
I-114	4-硝基肉桂基	H	H	Br	H
I-115	4-甲氧基肉桂基	H	H	Br	H
I-116	4-甲基肉桂基	H	H	Br	H
I-117	4-三氟甲基肉桂基	H	H	Br	H
I-118	4-氟基肉桂基	H	H	Br	H
I-119	2,4-二氟肉桂基	H	H	Br	H
I-120	2,4-二氟肉桂基	H	H	Br	H
I-121	肉桂基	H	H	H	Br
I-122	4-氟肉桂基	H	H	H	Br
I-123	4-氟桂基	H	H	H	Br
I-124	4-硝基肉桂基	H	H	H	Br
I-125	4-甲氧基肉桂基	H	H	H	Br

I-126	4-甲基肉桂基	H	H	H	Br
I-127	4-三氟甲基肉桂基	H	H	H	Br
I-128	4-氟基肉桂基	H	H	H	Br
I-129	2,4-二氟肉桂基	H	H	H	Br
I-130	2,4-二氟肉桂基	H	H	H	Br
I-131	肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-132	4-氟肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-133	4-氟桂基	H	Cl	H	Cl
I-134	4-硝基肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-135	4-甲氧基肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-136	4-甲基肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-137	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-138	4-氟基肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-139	2,4-二氟肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-140	2,4-二氟肉桂基	H	Cl	H	Cl
I-141	肉桂基	H	F	H	F
I-142	4-氟肉桂基	H	F	H	F
I-143	4-氟桂基	H	F	H	F
I-144	4-硝基肉桂基	H	F	H	F
I-145	4-甲氧基肉桂基	H	F	H	F
I-146	4-甲基肉桂基	H	F	H	F
I-147	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	F
I-148	4-氟基肉桂基	H	F	H	F

I-149	2,4-二氟肉桂基	H	F	H	F
I-150	2,4-二氟肉桂基	H	F	H	F
I-151	肉桂基	Cl	F	H	H
I-152	4-氟肉桂基	Cl	F	H	H
I-153	4-氟桂基	Cl	F	H	H
I-154	4-硝基肉桂基	Cl	F	H	H
I-155	4-甲氧基肉桂基	Cl	F	H	H
I-156	4-甲基肉桂基	Cl	F	H	H
I-157	4-三氟甲基肉桂基	Cl	F	H	H
I-158	4-氟基肉桂基	Cl	F	H	H
I-159	2,4-二氟肉桂基	Cl	F	H	H
I-160	2,4-二氟肉桂基	Cl	F	H	H
I-161	肉桂基	H	F	Cl	H
I-162	4-氟肉桂基	H	F	Cl	H
I-163	4-氟桂基	H	F	Cl	H
I-164	4-硝基肉桂基	H	F	Cl	H
I-165	4-甲氧基肉桂基	H	F	Cl	H
I-166	4-甲基肉桂基	H	F	Cl	H
I-167	4-三氟甲基肉桂基	H	F	Cl	H
I-168	4-氟基肉桂基	H	F	Cl	H
I-169	2,4-二氟肉桂基	H	F	Cl	H
I-170	2,4-二氟肉桂基	H	F	Cl	H
I-171	肉桂基	H	Cl	Cl	H

I-172	4-氯肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-173	4-氟桂基	H	Cl	Cl	H
I-174	4-硝基肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-175	4-甲氧基肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-176	4-甲基肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-177	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-178	4-氟基肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-179	2,4-二氯肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-180	2,4-二氟肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-181	肉桂基	H	I	H	H
I-182	4-氯肉桂基	H	I	H	H
I-183	4-氟桂基	H	I	H	H
I-184	4-硝基肉桂基	H	I	H	H
I-185	4-甲氧基肉桂基	H	I	H	H
I-186	4-甲基肉桂基	H	I	H	H
I-187	4-三氟甲基肉桂基	H	I	H	H
I-188	4-氟基肉桂基	H	I	H	H
I-189	2,4-二氯肉桂基	H	I	H	H
I-190	2,4-二氟肉桂基	H	I	H	H
I-191	肉桂基	H	OMe	H	H
I-192	4-氯肉桂基	H	OMe	H	H
I-193	4-氟桂基	H	OMe	H	H
I-194	4-硝基肉桂基	H	OMe	H	H

I-195	4-甲氧基肉桂基	H	OMe	H	H
I-196	4-甲基肉桂基	H	OMe	H	H
I-197	4-三氟甲基肉桂基	H	OMe	H	H
I-198	4-氟基肉桂基	H	OMe	H	H
I-199	2,4-二氟肉桂基	H	OMe	H	H
I-200	2,4-二氟肉桂基	H	OMe	H	H
I-201	肉桂基	H	Me	H	H
I-202	4-氟肉桂基	H	Me	H	H
I-203	4-氟桂基	H	Me	H	H
I-204	4-硝基肉桂基	H	Me	H	H
I-205	4-甲氧基肉桂基	H	Me	H	H
I-206	4-甲基肉桂基	H	Me	H	H
I-207	4-三氟甲基肉桂基	H	Me	H	H
I-208	4-氟基肉桂基	H	Me	H	H
I-209	2,4-二氟肉桂基	H	Me	H	H
I-210	2,4-二氟肉桂基	H	Me	H	H
I-211	肉桂基	H	CN	H	H
I-212	4-氟肉桂基	H	CN	H	H
I-213	4-氟桂基	H	CN	H	H
I-214	4-硝基肉桂基	H	CN	H	H
I-215	4-甲氧基肉桂基	H	CN	H	H
I-216	4-甲基肉桂基	H	CN	H	H
I-217	4-三氟甲基肉桂基	H	CN	H	H

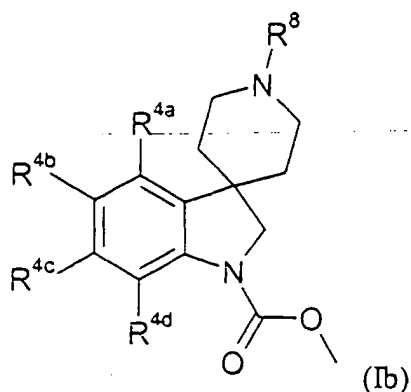
I-218	4-氟基肉桂基	H	CN	H	H
I-219	2,4-二氟肉桂基	H	CN	H	H
I-220	2,4-二氟肉桂基	H	CN	H	H
I-221	肉桂基	H	CCH	H	H
I-222	4-氟肉桂基	H	CCH	H	H
I-223	4-氟桂基	H	CCH	H	H
I-224	4-硝基肉桂基	H	CCH	H	H
I-225	4-甲氧基肉桂基	H	CCH	H	H
I-226	4-甲基肉桂基	H	CCH	H	H
I-227	4-三氟甲基肉桂基	H	CCH	H	H
I-228	4-氟基肉桂基	H	CCH	H	H
I-229	2,4-二氟肉桂基	H	CCH	H	H
I-230	2,4-二氟肉桂基	H	CCH	H	H
I-231	肉桂基	H	COOMe	H	H
I-232	4-氟肉桂基	H	COOMe	H	H
I-233	4-氟桂基	H	COOMe	H	H
I-234	4-硝基肉桂基	H	COOMe	H	H
I-235	4-甲氧基肉桂基	H	COOMe	H	H
I-236	4-甲基肉桂基	H	COOMe	H	H
I-237	4-三氟甲基肉桂基	H	COOMe	H	H
I-238	4-氟基肉桂基	H	COOMe	H	H
I-239	2,4-二氟肉桂基	H	COOMe	H	H
I-240	2,4-二氟肉桂基	H	COOMe	H	H

I-241	肉桂基	H	Me	Cl	H
I-242	4-氯肉桂基	H	Me	Cl	H
I-243	4-氟桂基	H	Me	Cl	H
I-244	4-硝基肉桂基	H	Me	Cl	H
I-245	4-甲氧基肉桂基	H	Me	Cl	H
I-246	4-甲基肉桂基	H	Me	Cl	H
I-247	4-三氟甲基肉桂基	H	Me	Cl	H
I-248	4-氰基肉桂基	H	Me	Cl	H
I-249	2,4-二氯肉桂基	H	Me	Cl	H
I-250	2,4-二氟肉桂基	H	Me	Cl	H
I-251	肉桂基	Cl	Me	H	H
I-252	4-氯肉桂基	Cl	Me	H	H
I-253	4-氟桂基	Cl	Me	H	H
I-254	4-硝基肉桂基	Cl	Me	H	H
I-255	4-甲氧基肉桂基	Cl	Me	H	H
I-256	4-甲基肉桂基	Cl	Me	H	H
I-257	4-三氟甲基肉桂基	Cl	Me	H	H
I-258	4-氰基肉桂基	Cl	Me	H	H
I-259	2,4-二氯肉桂基	Cl	Me	H	H
I-260	2,4-二氟肉桂基	Cl	Me	H	H
I-261	肉桂基	H	Cl	H	Me
I-262	4-氯肉桂基	H	Cl	H	Me
I-263	4-氟桂基	H	Cl	H	Me

I-264	4-硝基肉桂基	H	Cl	H	Me
I-265	4-甲氧基肉桂基	H	Cl	H	Me
I-266	4-甲基肉桂基	H	Cl	H	Me
I-267	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	H	Me
I-268	4-氟基肉桂基	H	Cl	H	Me
I-269	2,4-二氟肉桂基	H	Cl	H	Me
I-270	2,4-二氟肉桂基	H	Cl	H	Me
I-271	肉桂基	H	H	4-Cl-PhO	H
I-272	4-氟肉桂基	H	H	4-Cl-PhO	H
I-273	4-氟桂基	H	H	4-Cl-PhO	H
I-274	4-硝基肉桂基	H	H	4-Cl-PhO	H
I-275	4-甲氧基肉桂基	H	H	4-Cl-PhO	H
I-276	4-甲基肉桂基	H	H	4-Cl-PhO	H
I-277	4-三氟甲基肉桂基	H	H	4-Cl-PhO	H
I-278	4-氟基肉桂基	H	H	4-Cl-PhO	H
I-279	2,4-二氟肉桂基	H	H	4-Cl-PhO	H
I-280	2,4-二氟肉桂基	H	H	4-Cl-PhO	H
I-281	肉桂基	H	4-F-Ph	H	H
I-282	4-氟肉桂基	H	4-F-Ph	H	H
I-283	4-氟桂基	H	4-F-Ph	H	H
I-284	4-硝基肉桂基	H	4-F-Ph	H	H
I-285	4-甲氧基肉桂基	H	4-F-Ph	H	H
I-286	4-甲基肉桂基	H	4-F-Ph	H	H

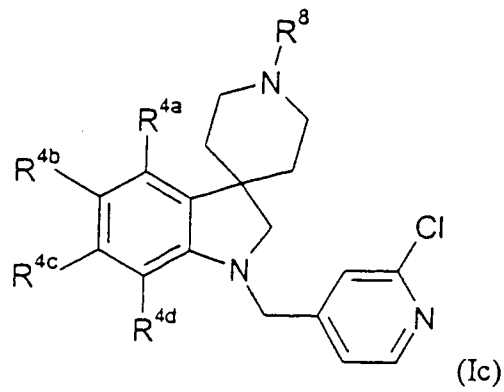
I-287	4-三氟甲基肉桂基	H	4-F-Ph	H	H
I-288	4-氟基肉桂基	H	4-F-Ph	H	H
I-289	2,4-二氟肉桂基	H	4-F-Ph	H	H
I-290	2,4-二氟肉桂基	H	4-F-Ph	H	H
I-291	肉桂基	H	CF ₃ O	H	H
I-292	4-氟肉桂基	H	CF ₃ O	H	H
I-293	4-氟桂基	H	CF ₃ O	H	H
I-294	4-硝基肉桂基	H	CF ₃ O	H	H
I-295	4-甲氧基肉桂基	H	CF ₃ O	H	H
I-296	4-甲基肉桂基	H	CF ₃ O	H	H
I-297	4-三氟甲基肉桂基	H	CF ₃ O	H	H
I-298	4-氟基肉桂基	H	CF ₃ O	H	H
I-299	2,4-二氟肉桂基	H	CF ₃ O	H	H
I-300	2,4-二氟肉桂基	H	CF ₃ O	H	H
I-301	C(O)CH=CH-4-氟苯基	H	4-CF ₃ -Ph	H	H

表II提供301種式Ib化合物



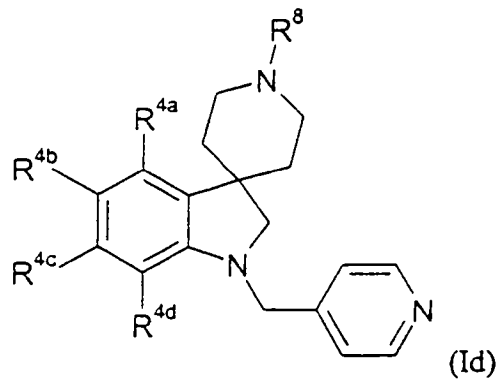
其中R⁸、R^{4a}、R^{4b}、R^{4c}與R^{4d}示於表1。

表 III 提供 301 種式 Ic 化合物



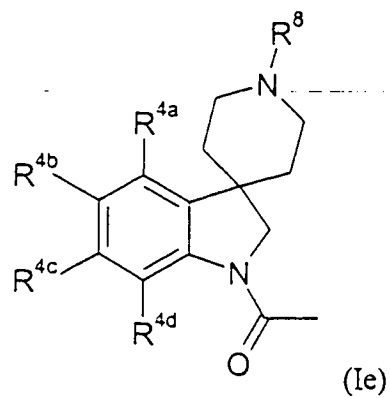
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 IV 提供 301 種式 Id 化合物



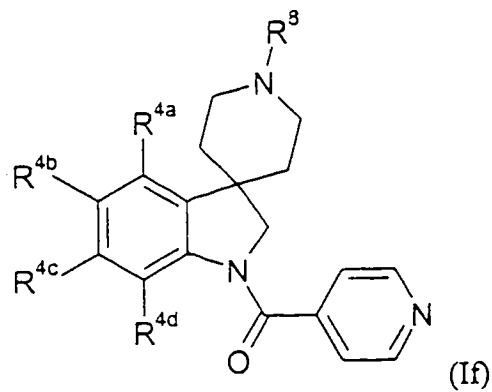
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 V 提供 301 種式 Ie 化合物



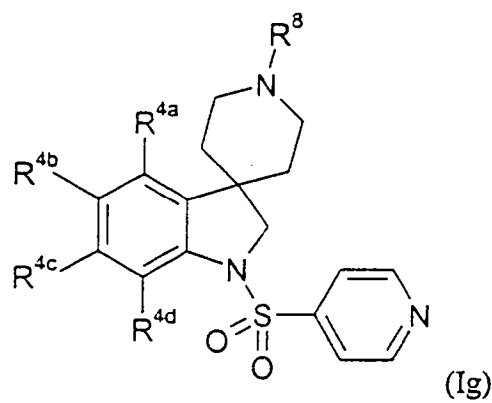
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 VI 提供 301 種式 If 化合物



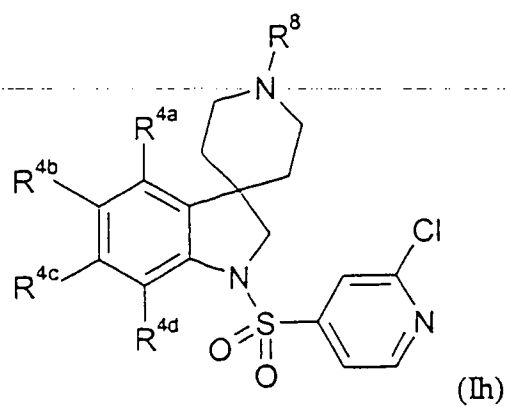
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 VII 提供 301 種式 Ig 化合物



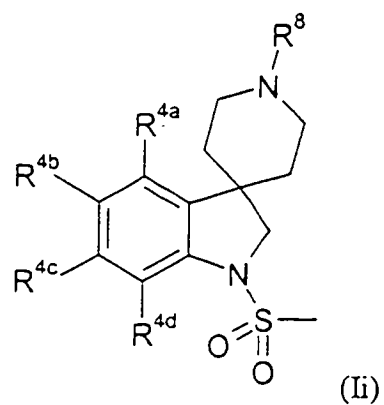
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 VIII 提供 301 種式 Ih 化合物



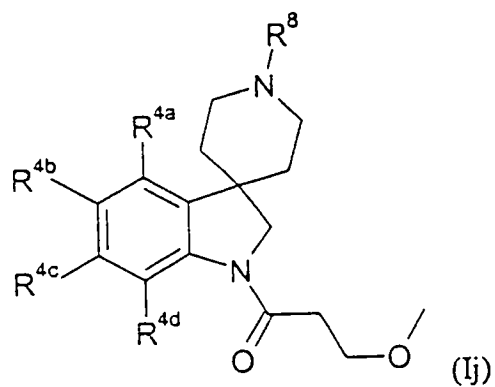
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 IX 提供 301 種式 Ii 化合物



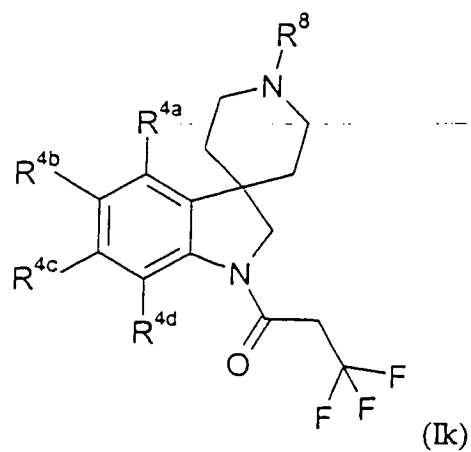
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 X 提供 301 種式 Ij 化合物



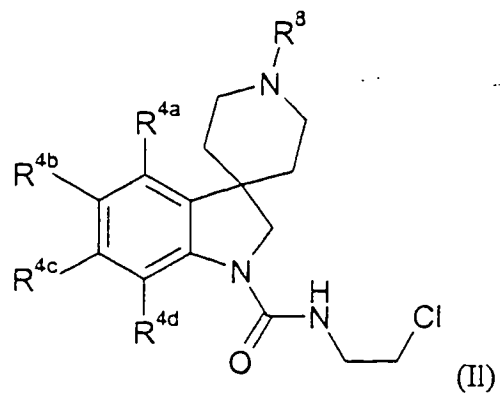
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XI 提供 301 種式 Ik 化合物



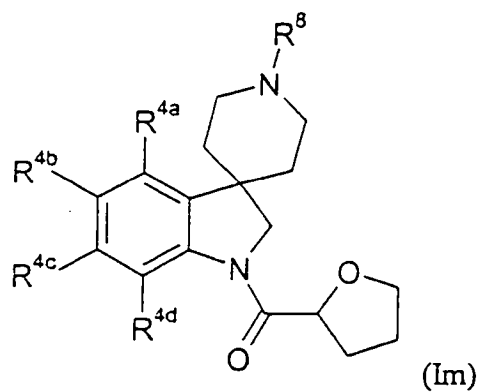
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XII 提供 301 種式 II 化合物



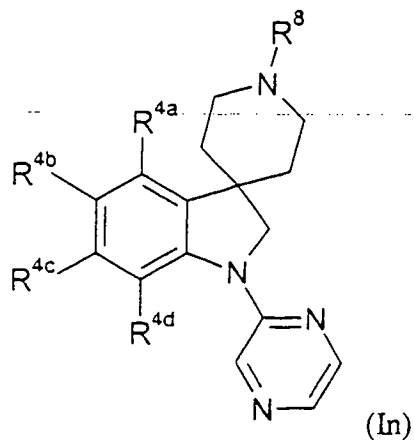
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XIII 提供 301 種式 Im 化合物



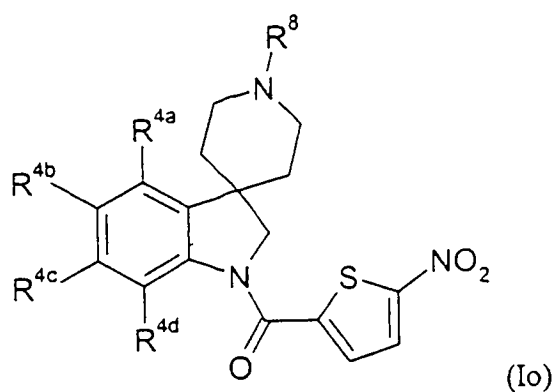
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XIV 提供 301 種式 In 化合物



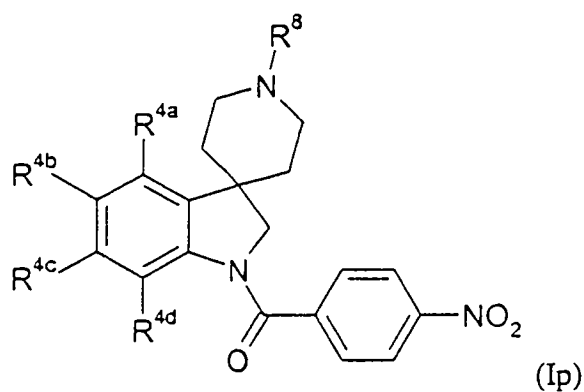
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XV 提供 301 種式 Io 化合物



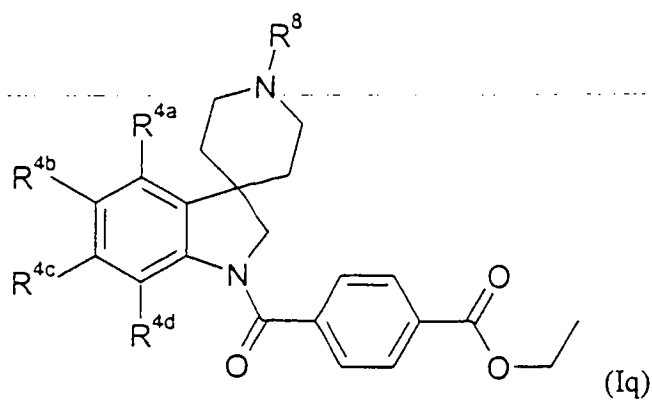
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XVI 提供 301 種式 Ip 化合物



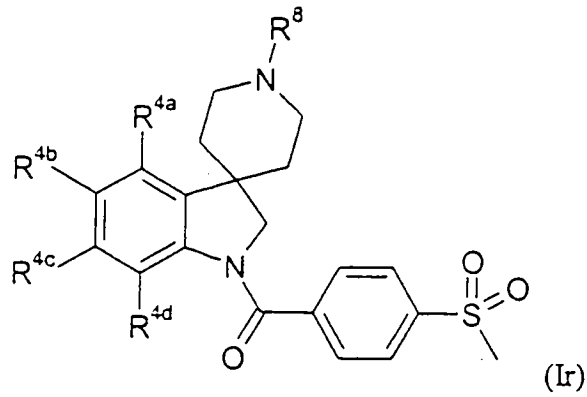
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XVII 提供 301 種式 Iq 化合物



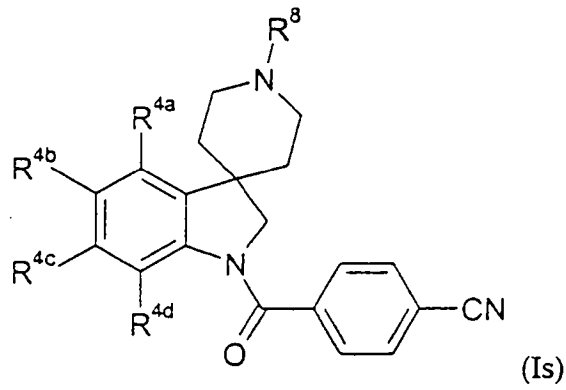
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XVIII 提供 301 種式 Ir 化合物



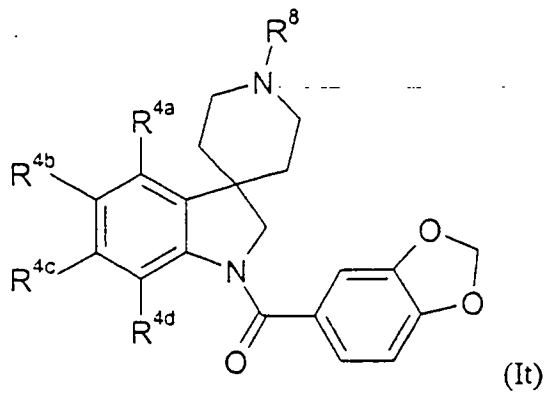
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XIX 提供 301 種式 Is 化合物



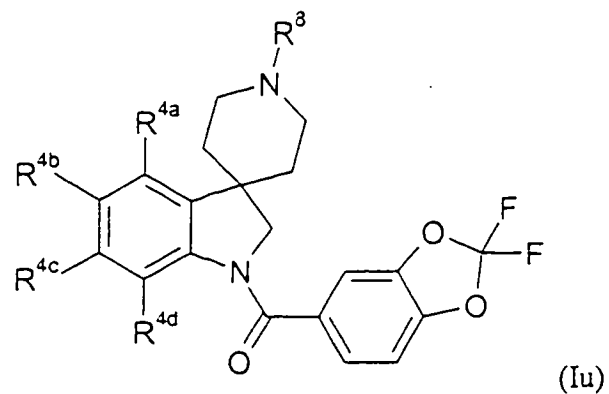
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XX 提供 301 種式 It 化合物



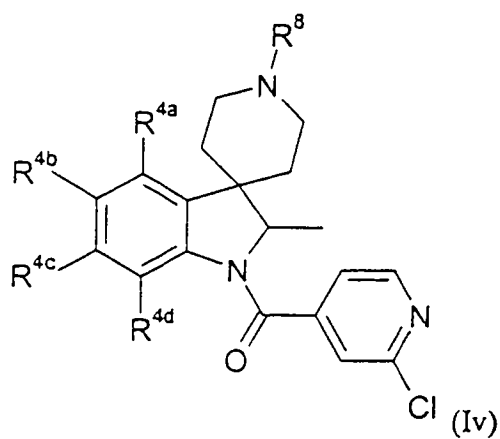
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XXI 提供 301 種式 Iu 化合物



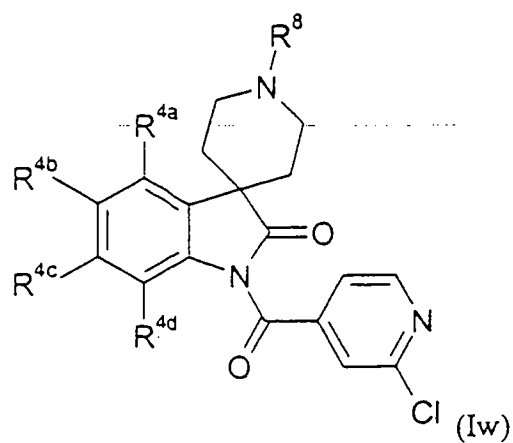
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XXII 提供 301 種式 Iv 化合物



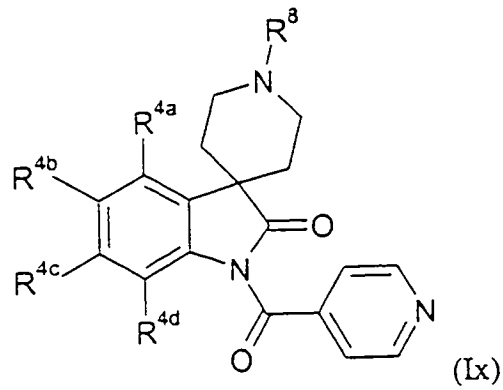
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XXIII 提供 301 種式 Iw 化合物



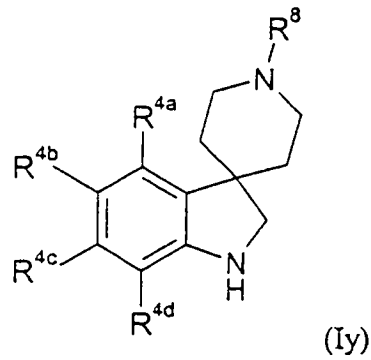
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XXIV 提供 301 種式 Ix 化合物



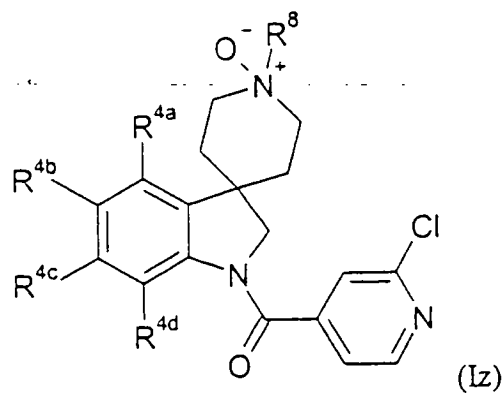
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XXV 提供 301 種式 Iy 化合物



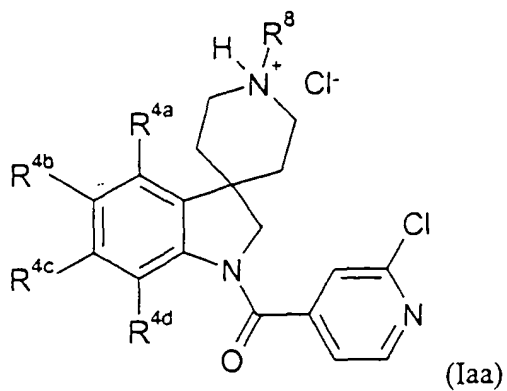
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XXVI 提供 301 種式 Iz 化合物



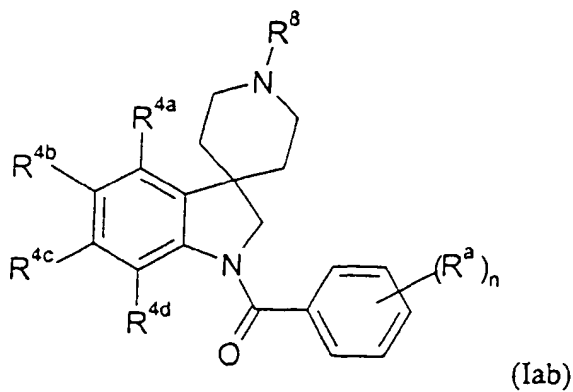
其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XXVII 提供 301 種式 Iaa 化合物



其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 與 R^{4d} 示於表 1。

表 XXVIII 提供 270 種式 Iab 化合物



其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 R^{4c} 、 R^{4d} 與 $(R^a)_n$ 示於表 2。

表 2

化合物	R^8	R^{4a}	R^{4b}	R^{4c}	R^{4d}	$(R^a)_n$
XXVIII-1	肉桂基	H	H	H	H	4-SMe
XXVIII-2	4-氯肉桂基	H	H	H	H	4-SMe
XXVIII-3	4-氟肉桂基	H	H	H	H	4-SMe
XXVIII-4	4-三氟甲基肉桂基	H	H	H	H	4-SMe
XXVIII-5	4-氰基肉桂基	H	H	H	H	4-SMe
XXVIII-6	肉桂基	H	Cl	H	H	4-SMe

XXVIII-7	4-氯肉桂基	H	Cl	H	H	4-SMe
XXVIII-8	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	4-SMe
XXVIII-9	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	H	H	4-SMe
XXVIII-10	4-氟基肉桂基	H	Cl	H	H	4-SMe
XXVIII-11	肉桂基	H	F	H	H	4-SMe
XXVIII-12	4-氯肉桂基	H	F	H	H	4-SMe
XXVIII-13	4-氟肉桂基	H	F	H	H	4-SMe
XXVIII-14	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	H	4-SMe
XXVIII-15	4-氟基肉桂基	H	F	H	H	4-SMe
XXVIII-16	肉桂基	H	H	F	H	4-SMe
XXVIII-17	4-氯肉桂基	H	H	F	H	4-SMe
XXVIII-18	4-氟肉桂基	H	H	F	H	4-SMe
XXVIII-19	4-三氟甲基肉桂基	H	H	F	H	4-SMe
XXVIII-20	4-氟基肉桂基	H	H	F	H	4-SMe
XXVIII-21	肉桂基	H	F	H	F	4-SMe
XXVIII-22	4-氯肉桂基	H	F	H	F	4-SMe
XXVIII-23	4-氟肉桂基	H	F	H	F	4-SMe
XXVIII-24	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	F	4-SMe
XXVIII-25	4-氟基肉桂基	H	F	H	F	4-SMe
XXVIII-26	肉桂基	H	OMe	H	H	4-SMe
XXVIII-27	4-氯肉桂基	H	OMe	H	H	4-SMe
XXVIII-28	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	4-SMe
XXVIII-29	4-三氟甲基肉桂基	H	OMe	H	H	4-SMe

XXVIII-30	4-氟基肉桂基	H	OMe	H	H	4-SMe
XXVIII-31	肉桂基	H	H	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-32	4-氟肉桂基	H	H	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-33	4-氟肉桂基	H	H	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-34	4-三氟甲基肉桂基	H	H	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-35	4-氟基肉桂基	H	H	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-36	肉桂基	H	Cl	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-37	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-38	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-39	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-40	4-氟基肉桂基	H	Cl	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-41	肉桂基	H	F	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-42	4-氟肉桂基	H	F	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-43	4-氟肉桂基	H	F	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-44	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-45	4-氟基肉桂基	H	F	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-46	肉桂基	H	H	F	H	4-C(O)Ph
XXVIII-47	4-氟肉桂基	H	H	F	H	4-C(O)Ph
XXVIII-48	4-氟肉桂基	H	H	F	H	4-C(O)Ph
XXVIII-49	4-三氟甲基肉桂基	H	H	F	H	4-C(O)Ph
XXVIII-50	4-氟基肉桂基	H	H	F	H	4-C(O)Ph
XXVIII-51	肉桂基	H	F	H	F	4-C(O)Ph
XXVIII-52	4-氟肉桂基	H	F	H	F	4-C(O)Ph

XXVIII-53	4-氟肉桂基	H	F	H	F	4-C(O)Ph
XXVIII-54	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	F	4-C(O)Ph
XXVIII-55	4-氟基肉桂基	H	F	H	F	4-C(O)Ph
XXVIII-56	肉桂基	H	OMe	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-57	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-58	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-59	4-三氟甲基肉桂基	H	OMe	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-60	4-氟基肉桂基	H	OMe	H	H	4-C(O)Ph
XXVIII-61	肉桂基	H	H	H	H	4-F
XXVIII-62	4-氟肉桂基	H	H	H	H	4-F
XXVIII-63	4-氟肉桂基	H	H	H	H	4-F
XXVIII-64	4-三氟甲基肉桂基	H	H	H	H	4-F
XXVIII-65	4-氟基肉桂基	H	H	H	H	4-F
XXVIII-66	肉桂基	H	Cl	H	H	4-F
XXVIII-67	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	4-F
XXVIII-68	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	4-F
XXVIII-69	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	H	H	4-F
XXVIII-70	4-氟基肉桂基	H	Cl	H	H	4-F
XXVIII-71	肉桂基	H	F	H	H	4-F
XXVIII-72	4-氟肉桂基	H	F	H	H	4-F
XXVIII-73	4-氟肉桂基	H	F	H	H	4-F
XXVIII-74	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	H	4-F
XXVIII-75	4-氟基肉桂基	H	F	H	H	4-F

XXVIII-76	肉桂基	H	H	F	H	4-F
XXVIII-77	4-氟肉桂基	H	H	F	H	4-F
XXVIII-78	4-氟肉桂基	H	H	F	H	4-F
XXVIII-79	4-三氟甲基肉桂基	H	H	F	H	4-F
XXVIII-80	4-氟基肉桂基	H	H	F	H	4-F
XXVIII-81	肉桂基	H	F	H	F	4-F
XXVIII-82	4-氟肉桂基	H	F	H	F	4-F
XXVIII-83	4-氟肉桂基	H	F	H	F	4-F
XXVIII-84	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	F	4-F
XXVIII-85	4-氟基肉桂基	H	F	H	F	4-F
XXVIII-86	肉桂基	H	OMe	H	H	4-F
XXVIII-87	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	4-F
XXVIII-88	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	4-F
XXVIII-89	4-三氟甲基肉桂基	H	OMe	H	H	4-F
XXVIII-90	4-氟基肉桂基	H	OMe	H	H	4-F
XXVIII-91	肉桂基	H	H	H	H	3-CN
XXVIII-92	4-氟肉桂基	H	H	H	H	3-CN
XXVIII-93	4-氟肉桂基	H	H	H	H	3-CN
XXVIII-94	4-三氟甲基肉桂基	H	H	H	H	3-CN
XXVIII-95	4-氟基肉桂基	H	H	H	H	3-CN
XXVIII-96	肉桂基	H	Cl	H	H	3-CN
XXVIII-97	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	3-CN
XXVIII-98	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	3-CN

XXVIII-99	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	H	H	3-CN
XXVIII-100	4-氟基肉桂基	H	Cl	H	H	3-CN
XXVIII-101	肉桂基	H	F	H	H	3-CN
XXVIII-102	4-氟肉桂基	H	F	H	H	3-CN
XXVIII-103	4-氟肉桂基	H	F	H	H	3-CN
XXVIII-104	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	H	3-CN
XXVIII-105	4-氟基肉桂基	H	F	H	H	3-CN
XXVIII-106	肉桂基	H	H	F	H	3-CN
XXVIII-107	4-氟肉桂基	H	H	F	H	3-CN
XXVIII-108	4-氟肉桂基	H	H	F	H	3-CN
XXVIII-109	4-三氟甲基肉桂基	H	H	F	H	3-CN
XXVIII-110	4-氟基肉桂基	H	H	F	H	3-CN
XXVIII-111	肉桂基	H	F	H	F	3-CN
XXVIII-112	4-氟肉桂基	H	F	H	F	3-CN
XXVIII-113	4-氟肉桂基	H	F	H	F	3-CN
XXVIII-114	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	F	3-CN
XXVIII-115	4-氟基肉桂基	H	F	H	F	3-CN
XXVIII-116	肉桂基	H	OMe	H	H	3-CN
XXVIII-117	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	3-CN
XXVIII-118	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	3-CN
XXVIII-119	4-三氟甲基肉桂基	H	OMe	H	H	3-CN
XXVIII-120	4-氟基肉桂基	H	OMe	H	H	3-CN
XXVIII-121	肉桂基	H	H	H	H	4-n-Pr

XXVIII-122	4-氟肉桂基	H	H	H	H	4-n-Pr
XXVIII-123	4-氟肉桂基	H	H	H	H	4-n-Pr
XXVIII-124	4-三氟甲基肉桂基	H	H	H	H	4-n-Pr
XXVIII-125	4-氟基肉桂基	H	H	H	H	4-n-Pr
XXVIII-126	肉桂基	H	Cl	H	H	4-n-Pr
XXVIII-127	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	4-n-Pr
XXVIII-128	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	4-n-Pr
XXVIII-129	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	H	H	4-n-Pr
XXVIII-130	4-氟基肉桂基	H	Cl	H	H	4-n-Pr
XXVIII-131	肉桂基	H	F	H	H	4-n-Pr
XXVIII-132	4-氟肉桂基	H	F	H	H	4-n-Pr
XXVIII-133	4-氟肉桂基	H	F	H	H	4-n-Pr
XXVIII-134	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	H	4-n-Pr
XXVIII-135	4-氟基肉桂基	H	F	H	H	4-n-Pr
XXVIII-136	肉桂基	H	H	F	H	4-n-Pr
XXVIII-137	4-氟肉桂基	H	H	F	H	4-n-Pr
XXVIII-138	4-氟肉桂基	H	H	F	H	4-n-Pr
XXVIII-139	4-三氟甲基肉桂基	H	H	F	H	4-n-Pr
XXVIII-140	4-氟基肉桂基	H	H	F	H	4-n-Pr
XXVIII-141	肉桂基	H	F	H	F	4-n-Pr
XXVIII-142	4-氟肉桂基	H	F	H	F	4-n-Pr
XXVIII-143	4-氟肉桂基	H	F	H	F	4-n-Pr
XXVIII-144	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	F	4-n-Pr

XXVIII-145	4-氟基肉桂基	H	F	H	F	4-n-Pr
XXVIII-146	肉桂基	H	OMe	H	H	4-n-Pr
XXVIII-147	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	4-n-Pr
XXVIII-148	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	4-n-Pr
XXVIII-149	4-三氟甲基肉桂基	H	OMe	H	H	4-n-Pr
XXVIII-150	4-氟基肉桂基	H	OMe	H	H	4-n-Pr
XXVIII-151	肉桂基	H	H	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-152	4-氟肉桂基	H	H	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-153	4-氟肉桂基	H	H	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-154	4-三氟甲基肉桂基	H	H	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-155	4-氟基肉桂基	H	H	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-156	肉桂基	H	Cl	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-157	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-158	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-159	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-160	4-氟基肉桂基	H	Cl	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-161	肉桂基	H	F	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-162	4-氟肉桂基	H	F	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-163	4-氟肉桂基	H	F	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-164	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-165	4-氟基肉桂基	H	F	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-166	肉桂基	H	H	F	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-167	4-氟肉桂基	H	H	F	H	2-OMe-4-SMe

XXVIII-168	4-氟肉桂基	H	H	F	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-169	4-三氟甲基肉桂基	H	H	F	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-170	4-氟基肉桂基	H	H	F	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-171	肉桂基	H	F	H	F	2-OMe-4-SMe
XXVIII-172	4-氟肉桂基	H	F	H	F	2-OMe-4-SMe
XXVIII-173	4-氟肉桂基	H	F	H	F	2-OMe-4-SMe
XXVIII-174	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	F	2-OMe-4-SMe
XXVIII-175	4-氟基肉桂基	H	F	H	F	2-OMe-4-SMe
XXVIII-176	肉桂基	H	OMe	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-177	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-178	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-179	4-三氟甲基肉桂基	H	OMe	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-180	4-氟基肉桂基	H	OMe	H	H	2-OMe-4-SMe
XXVIII-181	肉桂基	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-182	4-氟肉桂基	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-183	4-氟肉桂基	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-184	4-三氟甲基肉桂基	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-185	4-氟基肉桂基	H	H	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-186	肉桂基	H	Cl	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-187	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-188	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-189	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-190	4-氟基肉桂基	H	Cl	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me

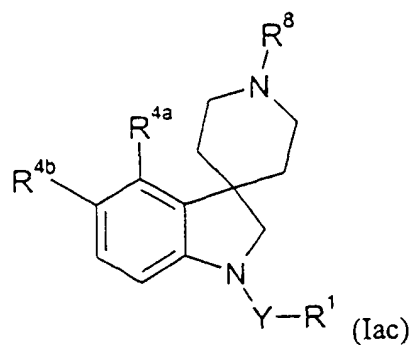
XXVIII-191	肉桂基	H	F	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-192	4-氟肉桂基	H	F	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-193	4-氟肉桂基	H	F	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-194	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-195	4-氟基肉桂基	H	F	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-196	肉桂基	H	H	F	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-197	4-氟肉桂基	H	H	F	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-198	4-氟肉桂基	H	H	F	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-199	4-三氟甲基肉桂基	H	H	F	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-200	4-氟基肉桂基	H	H	F	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-201	肉桂基	H	F	H	F	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-202	4-氟肉桂基	H	F	H	F	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-203	4-氟肉桂基	H	F	H	F	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-204	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	F	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-205	4-氟基肉桂基	H	F	H	F	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-206	肉桂基	H	OMe	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-207	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-208	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-209	4-三氟甲基肉桂基	H	OMe	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-210	4-氟基肉桂基	H	OMe	H	H	2-Cl-4-SO ₂ Me
XXVIII-211	肉桂基	H	H	H	H	4-n-PrO
XXVIII-212	4-氟肉桂基	H	H	H	H	4-n-PrO
XXVIII-213	4-氟肉桂基	H	H	H	H	4-n-PrO

XXVIII-214	4-三氟甲基肉桂基	H	H	H	H	4-n-PrO
XXVIII-215	4-氟基肉桂基	H	H	H	H	4-n-PrO
XXVIII-216	肉桂基	H	Cl	H	H	4-n-PrO
XXVIII-217	4-氯肉桂基	H	Cl	H	H	4-n-PrO
XXVIII-218	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	4-n-PrO
XXVIII-219	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	H	H	4-n-PrO
XXVIII-220	4-氟基肉桂基	H	Cl	H	H	4-n-PrO
XXVIII-221	肉桂基	H	F	H	H	4-n-PrO
XXVIII-222	4-氯肉桂基	H	F	H	H	4-n-PrO
XXVIII-223	4-氟肉桂基	H	F	H	H	4-n-PrO
XXVIII-224	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	H	4-n-PrO
XXVIII-225	4-氟基肉桂基	H	F	H	H	4-n-PrO
XXVIII-226	肉桂基	H	H	F	H	4-n-PrO
XXVIII-227	4-氯肉桂基	H	H	F	H	4-n-PrO
XXVIII-228	4-氟肉桂基	H	H	F	H	4-n-PrO
XXVIII-229	4-三氟甲基肉桂基	H	H	F	H	4-n-PrO
XXVIII-230	4-氟基肉桂基	H	H	F	H	4-n-PrO
XXVIII-231	肉桂基	H	F	H	F	4-n-PrO
XXVIII-232	4-氯肉桂基	H	F	H	F	4-n-PrO
XXVIII-233	4-氟肉桂基	H	F	H	F	4-n-PrO
XXVIII-234	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	F	4-n-PrO
XXVIII-235	4-氟基肉桂基	H	F	H	F	4-n-PrO
XXVIII-236	肉桂基	H	OMe	H	H	4-n-PrO

XXVIII-237	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	4-n-PrO
XXVIII-238	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	4-n-PrO
XXVIII-239	4-三氟甲基肉桂基	H	OMe	H	H	4-n-PrO
XXVIII-240	4-氟基肉桂基	H	OMe	H	H	4-n-PrO
XXVIII-241	肉桂基	H	H	H	H	2-Me
XXVIII-242	4-氟肉桂基	H	H	H	H	2-Me
XXVIII-243	4-氟肉桂基	H	H	H	H	2-Me
XXVIII-244	4-三氟甲基肉桂基	H	H	H	H	2-Me
XXVIII-245	4-氟基肉桂基	H	H	H	H	2-Me
XXVIII-246	肉桂基	H	Cl	H	H	2-Me
XXVIII-247	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	2-Me
XXVIII-248	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	2-Me
XXVIII-249	4-三氟甲基肉桂基	H	Cl	H	H	2-Me
XXVIII-250	4-氟基肉桂基	H	Cl	H	H	2-Me
XXVIII-251	肉桂基	H	F	H	H	2-Me
XXVIII-252	4-氟肉桂基	H	F	H	H	2-Me
XXVIII-253	4-氟肉桂基	H	F	H	H	2-Me
XXVIII-254	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	H	2-Me
XXVIII-255	4-氟基肉桂基	H	F	H	H	2-Me
XXVIII-256	肉桂基	H	H	F	H	2-Me
XXVIII-257	4-氟肉桂基	H	H	F	H	2-Me
XXVIII-258	4-氟肉桂基	H	H	F	H	2-Me
XXVIII-259	4-三氟甲基肉桂基	H	H	F	H	2-Me

XXVIII-260	4-氟基肉桂基	H	H	F	H	2-Me
XXVIII-261	肉桂基	H	F	H	F	2-Me
XXVIII-262	4-氯肉桂基	H	F	H	F	2-Me
XXVIII-263	4-氟肉桂基	H	F	H	F	2-Me
XXVIII-264	4-三氟甲基肉桂基	H	F	H	F	2-Me
XXVIII-265	4-氟基肉桂基	H	F	H	F	2-Me
XXVIII-266	肉桂基	H	OMe	H	H	2-Me
XXVIII-267	4-氯肉桂基	H	OMe	H	H	2-Me
XXVIII-268	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H	2-Me
XXVIII-269	4-三氟甲基肉桂基	H	OMe	H	H	2-Me
XXVIII-270	4-氟基肉桂基	H	OMe	H	H	2-Me

表 XXIX 提供 214 種式 Iac 化合物



其中 R^8 、 R^{4a} 、 R^{4b} 、 Y 與 R^1 示於表 3。

表 3

	R^8	R^{4a}	R^{4b}	Y	R^1
XXIX-1	2-(苯並呋唑基)甲基	H	Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-2	2-(苯並呋唑基)甲基	H	F	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-3	2-(苯並呋唑基)甲基	H	Cl	鍵結	甲酯基

XXIX-4	2-(苯並呋唑基)甲基	H	F	鍵結	甲酯基
XXIX-5	2-(苯並呋唑基)甲基	H	Cl	鍵結	乙醯基
XXIX-6	2-(苯並呋唑基)甲基	H	F	鍵結	乙醯基
XXIX-7	2-甲基-3-(3',4'-亞甲二 氧苯基)丙-2-烯基	H	Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-8	2-甲基-3-(3',4'-亞甲二 氧苯基)丙-2-烯基	H	F	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-9	2-甲基-3-(3',4'-亞甲二 氧苯基)丙-2-烯基	H	Cl	鍵結	甲酯基
XXIX-10	2-甲基-3-(3',4'-亞甲二 氧苯基)丙-2-烯基	H	F	鍵結	甲酯基
XXIX-11	2-甲基-3-(3',4'-亞甲二 氧苯基)丙-2-烯基	H	Cl	鍵結	乙醯基
XXIX-12	2-甲基-3-(3',4'-亞甲二 氧苯基)丙-2-烯基	H	F	鍵結	乙醯基
XXIX-13	3-苯丙-2-炔基	H	Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-14	3-苯丙-2-炔基	H	F	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-15	3-苯丙-2-炔基	H	Cl	鍵結	甲酯基
XXIX-16	3-苯丙-2-炔基	H	F	鍵結	甲酯基
XXIX-17	3-苯丙-2-炔基	H	Cl	鍵結	乙醯基
XXIX-18	3-苯丙-2-炔基	H	F	鍵結	乙醯基
XXIX-19	三氟乙醯胺基	H	Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-20	三氟乙醯胺基	H	F	C(O)	2-氯吡啶-4-基

XXIX-21	三氟乙醯胺基	H	Cl	鍵結	甲酯基
XXIX-22	三氟乙醯胺基	H	F	鍵結	甲酯基
XXIX-23	三氟乙醯胺基	H	Cl	鍵結	乙醯基
XXIX-24	三氟乙醯胺基	H	F	鍵結	乙醯基
XXIX-25	4-氯肉桂酸酯	H	Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-26	4-氯肉桂酸酯	H	F	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-27	4-氯肉桂酸酯	H	Cl	鍵結	甲酯基
XXIX-28	4-氯肉桂酸酯	H	F	鍵結	甲酯基
XXIX-29	4-氯肉桂酸酯	H	Cl	鍵結	乙醯基
XXIX-30	4-氯肉桂酸酯	H	F	鍵結	乙醯基
XXIX-31	2-氧代-2-(2'-氯-4'-甲 基)乙基	H	Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-32	2-氧代-2-(2'-氯-4'-甲 基)乙基	H	F	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-33	2-氧代-2-(2'-氯-4'-甲 基)乙基	H	Cl	鍵結	甲酯基
XXIX-34	2-氧代-2-(2'-氯-4'-甲 基)乙基	H	F	鍵結	甲酯基
XXIX-35	2-氧代-2-(2'-氯-4'-甲 基)乙基	H	Cl	鍵結	乙醯基
XXIX-36	2-氧代-2-(2'-氯-4'-甲 基)乙基	H	F	鍵結	乙醯基
XXIX-37	2-氧代-1,2-二苯基乙基	H	Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基

XXIX-38	2-氧代-1,2-二苯基乙基	H	F	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-39	2-氧代-1,2-二苯基乙基	H	Cl	鍵結	甲酯基
XXIX-40	2-氧代-1,2-二苯基乙基	H	F	鍵結	甲酯基
XXIX-41	2-氧代-1,2-二苯基乙基	H	Cl	鍵結	乙醯基
XXIX-42	2-氧代-1,2-二苯基乙基	H	F	鍵結	乙醯基
XXIX-43	3,3-二氯烯丙基	H	Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-44	3,3-二氯烯丙基	H	F	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-45	3,3-二氯烯丙基	H	Cl	鍵結	甲酯基
XXIX-46	3,3-二氯烯丙基	H	F	鍵結	甲酯基
XXIX-47	3,3-二氯烯丙基	H	Cl	鍵結	乙醯基
XXIX-48	3,3-二氯烯丙基	H	F	鍵結	乙醯基
XXIX-49	第三丁氧羰基	H	F	鍵結	H
XXIX-50	第三丁氧羰基	H	Cl	鍵結	H
XXIX-51	第三丁氧羰基	H	Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-52	第三丁氧羰基	H	F	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-53	第三丁氧羰基	H	Cl	鍵結	甲酯基
XXIX-54	第三丁氧羰基	H	F	鍵結	甲酯基
XXIX-55	第三丁氧羰基	H	Cl	鍵結	乙醯基
XXIX-56	第三丁氧羰基	H	F	鍵結	乙醯基
XXIX-57	4-氯肉桂基	H	Cl	鍵結	5-三氟甲基吡 啶-2-基
XXIX-58	4-氯肉桂基	H	F	鍵結	5-三氟甲基吡 啶-2-基

XXIX-59	4-氟肉桂基	Br	H	鍵結	5-三氟甲基吡 啶-2-基
XXIX-60	4-氟肉桂基	H	Cl	鍵結	5-三氟甲基吡 啶-2-基
XXIX-61	4-氟肉桂基	H	F	鍵結	5-三氟甲基吡 啶-2-基
XXIX-62	4-氟肉桂基	Br	H	鍵結	5-三氟甲基吡 啶-2-基
XXIX-63	4-氟肉桂基	H	Cl	鍵結	嘧啶-2-基
XXIX-64	4-氟肉桂基	H	F	鍵結	嘧啶-2-基
XXIX-65	4-氟肉桂基	Br	H	鍵結	嘧啶-2-基
XXIX-66	4-氟肉桂基	H	Cl	鍵結	嘧啶-2-基
XXIX-67	4-氟肉桂基	H	F	鍵結	嘧啶-2-基
XXIX-68	4-氟肉桂基	Br	H	鍵結	嘧啶-2-基
XXIX-69	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	吡啶基
XXIX-70	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	吡啶基
XXIX-71	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	吡啶基
XXIX-72	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	吡啶基
XXIX-73	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	吡啶基
XXIX-74	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	吡啶基
XXIX-75	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	2-氯吡啶-5-基
XXIX-76	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	2-氯吡啶-5-基
XXIX-77	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	2-氯吡啶-5-基

XXIX-78	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	2-氯吡啶-5-基
XXIX-79	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	2-氯吡啶-5-基
XXIX-80	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	2-氯吡啶-5-基
XXIX-81	4-氯肉桂基	H	Cl	C(O)	1,2,3-噁二唑-4-基
XXIX-82	4-氯肉桂基	H	F	C(O)	1,2,3-噁二唑-4-基
XXIX-83	4-氯肉桂基	Br	H	C(O)	1,2,3-噁二唑-4-基
XXIX-84	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	1,2,3-噁二唑-4-基
XXIX-85	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	1,2,3-噁二唑-4-基
XXIX-86	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	1,2,3-噁二唑-4-基
XXIX-87	4-氯肉桂基	H	Cl	C(O)	1-甲基-5-硝基 -[1H]-吡唑-4-基
XXIX-88	4-氯肉桂基	H	F	C(O)	1-甲基-5-硝基 -[1H]-吡唑-4-基
XXIX-89	4-氯肉桂基	Br	H	C(O)	1-甲基-5-硝基 -[1H]-吡唑-4-基
XXIX-90	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	1-甲基-5-硝基 -[1H]-吡唑-4-基

XXIX-91	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	1-甲基-5-硝基 -[1H]-吡啶-4-基
XXIX-92	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	1-甲基-5-硝基 -[1H]-吡啶-4-基
XXIX-93	4-氯肉桂基	H	Cl	C(O)	5-甲酯吡啶- 2-基
XXIX-94	4-氯肉桂基	H	F	C(O)	5-甲酯吡啶- 2-基
XXIX-95	4-氯肉桂基	Br	H	C(O)	5-甲酯吡啶- 2-基
XXIX-96	4-氯肉桂基	H	Cl	C(O)	5-甲酯吡啶- 2-基
XXIX-97	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	5-甲酯吡啶- 2-基
XXIX-98	4-氯肉桂基	Br	H	C(O)	5-甲酯吡啶- 2-基
XXIX-99	4-氯肉桂基	H	Cl	C(O)	4-氯吡啶-2-基
XXIX-100	4-氯肉桂基	H	F	C(O)	4-氯吡啶-2-基
XXIX-101	4-氯肉桂基	Br	H	C(O)	4-氯吡啶-2-基
XXIX-102	4-氯肉桂基	H	Cl	C(O)	4-氯吡啶-2-基
XXIX-103	4-氯肉桂基	H	F	C(O)	4-氯吡啶-2-基
XXIX-104	4-氯肉桂基	Br	H	C(O)	4-氯吡啶-2-基
XXIX-105	4-氯肉桂基	H	Cl	C(O)	2-甲基-6-三氟 甲基吡啶-3-基

XXIX-106	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	2-甲基-6-三氟 甲基吡啶-3-基
XXIX-107	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	2-甲基-6-三氟 甲基吡啶-3-基
XXIX-108	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	2-甲基-6-三氟 甲基吡啶-3-基
XXIX-109	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	2-甲基-6-三氟 甲基吡啶-3-基
XXIX-110	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	2-甲基-6-三氟 甲基吡啶-3-基
XXIX-111	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	5-甲基-異喹啉 -3-基
XXIX-112	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	5-甲基-異喹啉 -3-基
XXIX-113	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	5-甲基-異喹啉 -3-基
XXIX-114	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	5-甲基-異喹啉 -3-基
XXIX-115	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	5-甲基-異喹啉 -3-基
XXIX-116	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	5-甲基-異喹啉 -3-基
XXIX-117	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	(吡啶-4-基) 甲基

XXIX-118	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	(吡啶-4-基) 甲基
XXIX-119	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	(吡啶-4-基) 甲基
XXIX-120	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	(吡啶-4-基) 甲基
XXIX-121	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	(吡啶-4-基) 甲基
XXIX-122	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	(吡啶-4-基) 甲基
XXIX-123	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	(噻吩-2-基) 甲基
XXIX-124	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	(噻吩-2-基) 甲基
XXIX-125	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	(噻吩-2-基) 甲基
XXIX-126	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	(噻吩-2-基) 甲基
XXIX-127	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	(噻吩-2-基) 甲基
XXIX-128	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	(噻吩-2-基) 甲基
XXIX-129	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	環戊基

XXIX-130	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	環戊基
XXIX-131	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	環戊基
XXIX-132	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	環戊基
XXIX-133	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	環戊基
XXIX-134	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	環戊基
XXIX-135	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	乙醯胺甲基
XXIX-136	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	乙醯胺甲基
XXIX-137	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	乙醯胺甲基
XXIX-138	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	乙醯胺甲基
XXIX-139	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	乙醯胺甲基
XXIX-140	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	乙醯胺甲基
XXIX-141	4-氟肉桂基	H	Cl	SO ₂	4-乙醯胺苯基
XXIX-142	4-氟肉桂基	H	F	SO ₂	4-乙醯胺苯基
XXIX-143	4-氟肉桂基	Br	H	SO ₂	4-乙醯胺苯基
XXIX-144	4-氟肉桂基	H	Cl	SO ₂	4-乙醯胺苯基
XXIX-145	4-氟肉桂基	H	F	SO ₂	4-乙醯胺苯基
XXIX-146	4-氟肉桂基	Br	H	SO ₂	4-乙醯胺苯基
XXIX-147	4-氟肉桂基	H	Cl	SO ₂	3,5-二甲基異喹 啉-4-基
XXIX-148	4-氟肉桂基	H	F	SO ₂	3,5-二甲基異喹 啉-4-基
XXIX-149	4-氟肉桂基	Br	H	SO ₂	3,5-二甲基異喹 啉-4-基

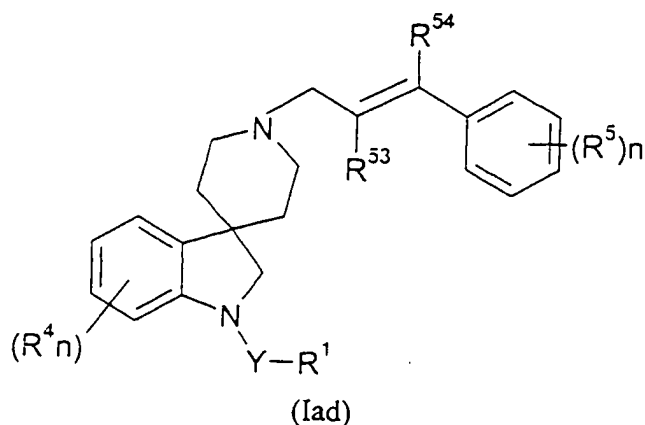
XXIX-150	4-氟肉桂基	H	Cl	SO ₂	3,5-二甲基異噁 唑-4-基
XXIX-151	4-氟肉桂基	H	F	SO ₂	3,5-二甲基異噁 唑-4-基
XXIX-152	4-氟肉桂基	Br	H	SO ₂	3,5-二甲基異噁 唑-4-基
XXIX-153	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	(2-甲氧苯基) 胺基
XXIX-154	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	(2-甲氧苯基) 胺基
XXIX-155	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	(2-甲氧苯基) 胺基
XXIX-156	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	(2-甲氧苯基) 胺基
XXIX-157	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	(2-甲氧苯基) 胺基
XXIX-158	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	(2-甲氧苯基) 胺基
XXIX-159	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	環己烯-1-基
XXIX-160	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	環己烯-1-基
XXIX-161	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	環己烯-1-基
XXIX-162	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	環己烯-1-基
XXIX-163	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	環己烯-1-基

XXIX-164	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	環己烯-1-基
XXIX-165	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	喹啉-3-基
XXIX-166	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	喹啉-3-基
XXIX-167	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	喹啉-3-基
XXIX-168	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	喹啉-3-基
XXIX-169	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	喹啉-3-基
XXIX-170	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	喹啉-3-基
XXIX-171	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	苯並噻吩-2-基
XXIX-172	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	苯並噻吩-2-基
XXIX-173	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	苯並噻吩-2-基
XXIX-174	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	苯並噻吩-2-基
XXIX-175	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	苯並噻吩-2-基
XXIX-176	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	苯並噻吩-2-基
XXIX-177	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	5-硝基-[1H]-吡 啶-3-基
XXIX-178	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	5-硝基-[1H]-吡 啶-3-基
XXIX-179	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	5-硝基-[1H]-吡 啶-3-基
XXIX-180	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	5-硝基-[1H]-吡 啶-3-基
XXIX-181	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	5-硝基-[1H]-吡 啶-3-基

XXIX-182	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	5-硝基-[1H]-吡 啶-3-基
XXIX-183	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	([1H]-四唑- 1-基)甲基
XXIX-184	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	([1H]-四唑- 1-基)甲基
XXIX-185	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	([1H]-四唑- 1-基)甲基
XXIX-186	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	([1H]-四唑- 1-基)甲基
XXIX-187	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	([1H]-四唑- 1-基)甲基
XXIX-188	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	([1H]-四唑- 1-基)甲基
XXIX-189	4-氟肉桂基	H	Cl	鍵結	苯甲基
XXIX-190	4-氟肉桂基	H	F	鍵結	苯甲基
XXIX-191	4-氟肉桂基	Br	H	鍵結	苯甲基
XXIX-192	4-氟肉桂基	H	Cl	鍵結	苯甲基
XXIX-193	4-氟肉桂基	H	F	鍵結	苯甲基
XXIX-194	4-氟肉桂基	Br	H	鍵結	苯甲基
XXIX-195	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	(4-氟苯基)胺基
XXIX-196	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	(4-氟苯基)胺基
XXIX-197	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	(4-氟苯基)胺基

XXIX-198	4-氟肉桂基	H	Cl	C(O)	(4-氟苯基)胺基
XXIX-199	4-氟肉桂基	H	F	C(O)	(4-氟苯基)胺基
XXIX-200	4-氟肉桂基	Br	H	C(O)	(4-氟苯基)胺基
XXIX-201	4-氟肉桂基	H	Me ₃ Si CC	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-202	4-氟肉桂基	H	Me ₃ Si CC	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-203	4-氟肉桂基	H	Me ₃ Si CC	鍵結	甲酯基
XXIX-204	4-氟肉桂基	H	Me ₃ Si CC	鍵結	甲酯基
XXIX-205	4-氟肉桂基	H	Me ₃ Si CC	鍵結	乙醯基
XXIX-206	4-氟肉桂基	H	Me ₃ Si CC	鍵結	乙醯基
XXIX-207	4-氟肉桂基	H	OMe	SO ₂	正丁基
XXIX-208	4-氟肉桂基	H	F	SO ₂	正丁基
XXIX-209	4-氟肉桂基	H	Cl	SO ₂	正丁基
XXIX-210	4-氟肉桂基	Br	H	SO ₂	正丁基
XXIX-211	4-氟肉桂基	H	OMe	SO ₂	正丁基
XXIX-212	4-氟肉桂基	H	Cl	SO ₂	正丁基
XXIX-213	4-氟肉桂基	H	F	SO ₂	正丁基
XXIX-214	4-氟肉桂基	Br	H	SO ₂	正丁基

表 XXX 提供 121 種 Iad 化合物



	R ⁴ _n	R53	R54	R ⁵ _n	Y	R1
XXX-1	6-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-2	6-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	2-氣吡啶4基
XXX-3	4-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-4	6-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-5	4-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-6	4-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	2-氣吡啶4基
XXX-7	6-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	2-氣吡啶4基
XXX-8	4-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	2-氣吡啶4基
XXX-9	7-O-Ph	H	H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-10	7-O-Ph	H	H	4-Cl	C(O)	2-氣吡啶4基
XXX-11	5-OCH ₂ CH ₃	H	H	4-Cl	C(O)	2-氣吡啶4基
XXX-12	6-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	2,6-二溴吡啶4基
XXX-13	6-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	2,6-二氣吡啶4基
XXX-14	6-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	吡啶-3-基
XXX-15	4-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	2,6-二溴吡啶4基
XXX-16	4-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	2,6-二氣吡啶4基
XXX-17	4-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	吡啶-3-基
XXX-18	4-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	2,6-二溴吡啶4基
XXX-19	4-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	2,6-二氣吡啶4基
XXX-20	4-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	吡啶-3-基
XXX-21	6-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	2,6-二溴吡啶4基
XXX-22	6-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	3,5-二氣吡啶4基

XXX-23	4-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	4,6-二甲氧-嘧啶-2-基
XXX-24	4-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	4,6-二甲氧-嘧啶-2-基
XXX-25	6-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-3-基
XXX-26	7-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-3-基
XXX-27	6-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-3-基
XXX-28	4-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-3-基
XXX-29	5-O(4-三氟甲基-苯基)	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-3-基
XXX-30	5-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-31	5-F	H	H	4-F	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-32	5-Cl	H	H	2,4-Cl ₂	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-33	5,7-Cl ₂	H	H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-34	7-Cl	H	H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-35	7-Cl	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-36	5,7-二甲基	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-37	4,7-二甲基	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-38	6-CF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-39	4,6-Cl ₂	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-40	4,6-Cl ₂	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-41	5-異丙基	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-42	5-Br	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基

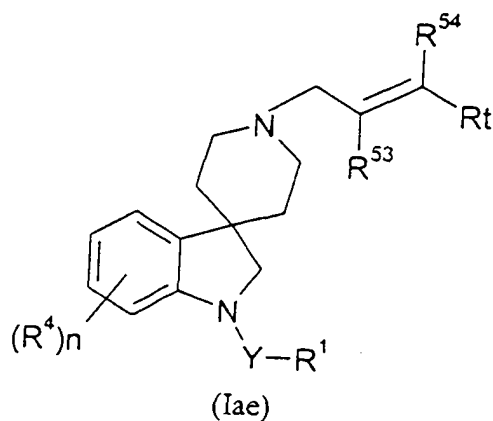
XXX-43	6,7-二甲基	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-44	5,6-Cl ₂	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-3-基
XXX-45	4-CF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-46	7-CH ₂ Cl	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-47	7-Br	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-48	5-第三丁基	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-49	4,6-二甲基	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-50	4-CF ₃ -7-Cl	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-51	5-Cl	H	H	4-CF ₃	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-52	5-Cl	H	H	4-CH=CH ₂	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-53	5-Cl	H	H	4-CF ₃	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-54	5-Cl	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-55	5-Cl	H	H	4-NO ₂	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-56	5-Cl	H	H	3,5-(CF ₃) ₂	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-57	5-Cl	H	H	3-Br	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-58	5-Cl	H	H	3-乙氧基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-59	5-Cl	H	H	2-Me	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-60	5-Cl	H	H	4-Me	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-61	5-Cl	H	H	3-Cl,4-F	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-62	5-Cl	H	H	3,5-Cl ₂	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-63	5-Cl	H	H	4-N ₃	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-64	5-Cl	H	H	2-Br	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-65	5-Cl	H	H	2,6-二甲 氧基	C(O)	2-氯吡啶-4-基

XXX-66	5-Cl	H	H	4-乙氧基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-67	5-Cl	H	H	3-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-68	5-Cl	H	H	3-Me,4-OMe, 5-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-69	5-Cl	H	H	4-Oph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-70	5-Cl	H	H	4-CN	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-71	5-Cl	H	H	3-F,4-Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-72	5-Cl	H	H	4-SMe	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-73	5-Cl	H	H	3-Br	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-74	5-Cl	H	H	4-F	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-75	5-Cl	H	H	4-Br	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-76	5-Cl	H	H	2,4-Cl ₂	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-77	5-Cl	H	H	2,4-F ₂	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-78	5-Cl	H	H	3-CF ₃	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-79	5-Cl	H	H	3,4-二乙 氧基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-80	5-Cl	H	H	3-Me,4-F	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-81	5-Cl	H	H	4-Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-82	5-Cl	H	Me	4-Cl	C(O)	Me
XXX-83	5-Cl	H	Me	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-84	5-Cl	H	Me	4-F	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-85	5-Cl	H	Me	4-F	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-86	5-Cl	H	H	4-OCF ₃	C(O)	2-氯吡啶-4-基

XXX-87	5-Cl	H	H	4-OCF ₃	C(O)	Me
XXX-88	5-Cl	H	F	H	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-89	5-Cl	H	F	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-90	5-Cl	H	F	4-Cl	C(O)	Me
XXX-91	5-Cl	H	CF ₃	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-92	5-Cl	H	CF ₃	4-Cl	C(O)	Me
XXX-93	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	咪唑-2-基
XXX-94	5-F	H	H	4-Cl	鍵結	NH ₂
XXX-95	5-F	H	H	4-Cl	鍵結	-NHCO-2-氯吡啶 -4-基
XXX-96	5-Cl	H	H	4-NO ₂	C(O)	Me
XXX-97	5-Cl	H	H	4-Cl	鍵結	NHCO-4-三氟甲 氧基-苯基
XXX-98	5-Cl	H	H	4-Cl	鍵結	-NHCO-吡啶-4-基
XXX-99	5-Cl	H	H	4-Cl	鍵結	-NHCO-3-氯吡啶 -4-基
XXX-100	5-F	H	H	4-Cl	鍵結	-NHCONH-4-三氟 甲氧基-苯基
XXX-101	5-F	H	H	4-Cl	鍵結	-NHCONH-3-氯 苯基
XXX-102	5-Cl	H	H	4-Cl	鍵結	-N=C(Me)NMe ₂
XXX-103	5-Cl	H	H	4-Cl	鍵結	-NHCONH-4-三氟 甲基-苯基

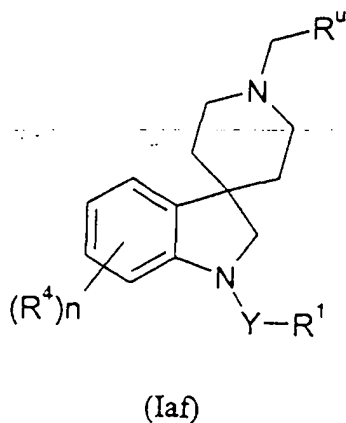
XXX-104	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH-異丙基
XXX-105	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH(CH ₂) ₂ OMe
XXX-106	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NHCH ₂ -吡啶-3- 基
XXX-107	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH(CH ₂) ₂ OH
XXX-108	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH(CH ₂) ₂ 嗎啉基
XXX-109	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NHCH ₂ -吡啶- 4基
XXX-110	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH-乙基
XXX-111	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH-甲基
XXX-112	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH-苯甲基
XXX-113	5-Cl	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4基
XXX-114	5-Cl	H	H	4-CF ₃	C(O)	2-氯吡啶-4基
XXX-115	5-Cl	H	Cl	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4基
XXX-116	5+6-O-CF ₂ O-	H	H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-117	5+6-O-CF ₂ O-	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4基
XXX-118	5+6-O-CH ₂ O-	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4基
XXX-119	5-F	H	H	4-Cl	鍵結	-NHCONH-4 氯 苯基
XXX-120	5-F	H	H	4-Cl	鍵結	乙基
XXX-121	5-Cl	H	H	4-Cl	鍵結	NO

表 XXXI 提供 8 種式 Iae 化合物



	R ⁴ _n	R ⁵³	R ⁵⁴	R ^t	Y	R ¹
XXXI-1	5-Cl	H	H	5-三氟甲基-吡啶-2-基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXI-2	5-F	H	H	5-氯-噻吩-2-基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXI-3	5-Cl	H	H	噻吩-2-基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXI-4	5-Cl	H	H	萘-2-基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXI-5	5-Cl	H	H	-CH=CH-苯基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXI-6	5-Cl	H	H	苯並噻吩-2-基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXI-7	5-Cl	H	H	-CH=CH-4-氯苯基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXI-8	5-Cl	H	H	Br	C(O)	2-氯吡啶-4-基

表 XXXII 提供 10 種式 Iaf 化合物



	R ⁴ _n	Ru	Y	R1
XXXII-1	5-Cl	4-F-Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-2	5-Cl	4-OCF ₃ Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-3	5-Cl	4-Cl-Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-4	5-F	6-F-萘-2-基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-5	5-Cl	-CH(OH)CH ₂ O-4-Cl-Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-6	5-Cl	-C(Me)=NO-Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-7	5-Cl	5-Cl-苯並呋唑-2-基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-8	5-Cl	4-NHCOOCH(Me) ₂ -Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-9	5-Cl	4-NHCOOCH(Me) ₂ -Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-10	5-Cl	(2-乙基-四唑-5-基)-4-Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基

表 I 至 XXIX 中所選定化合物之質譜數據係得自 Micromass Platform 2 儀器。數據示於表 3。

Table 3	
化合物No.	MS 數據
I-1	444 (95%), 446 (100%)
I-2	478 (100%), 480 (70%), 482 (15%)
I-3	462 (100%), 464 (95%)
I-4	489 (100%), 491 (70%)
I-5	147 (100%), 474 (30%), 476 (80%)
I-12	512 (95%), 514 (100%), 516 (35%), 518 (5%)
I-21	478 (100%), 480 (70%), 482 (15%)
I-22	512 (100%), 514 (98%), 516 (35%), 518 (5%)

I-23	496 (100%), 498 (75%), 500 (15%)
I-32	512 (90%), 514 (100%), 516 (35%), 518 (5%)
I-52	496 (100%), 498 (70%), 500 (15%)
I-61	462 (100%), 464 (30%)
I-62	496 (100%), 498 (80%), 500 (20%)
I-72	496 (100%), 498 (70%), 500 (15%)
I-82	496 (100%), 498 (75%), 500 (15%)
I-92	556 (55%), 558 (100%), 560 (40%), 562 (8%)

I-112	556 (55%), 558 (100%), 560 (40%), 562 (8%)
I-132	546 (75%), 548 (100%), 550 (40%), 552 (10%)
I-142	514 (100%), 516 (70%), 518 (15%)
I-152	530 (97%), 532 (100%), 534 (40%), 536 (5%)
I-162	530 (100%), 532 (97%), 534 (40%), 536 (5%)
I-171	512 (98%), 514 (100%), 516 (35%), 518 (5%)
I-182	604 (100%), 606 (70%), 608 (15%)

I-192	508 (100%), 510 (80%), 512 (20%)
I-202	492 (100%), 494 (70%), 496 (15%)
I-212	503 (100%), 505 (70%), 507 (15%)
I-222	502 (100%), 504 (70%), 506 (15%)
I-232	536 (100%), 538 (70%), 540 (15%)
I-242	526 (100%), 528 (99%), 530 (35%), 532 (5%)
I-252	526 (100%), 528 (90%), 530 (35%), 532 (5%)
I-262	526 (95%), 528 (100%), 530 (35%), 532 (5%)

I-282	572 (100%), 574 (80%), 576 (20%)
I-292	562 (100%), 564 (70%), 566 (15%)
II-22	431 (100%), 433 (60%), 435 (15%)
II-62	415 (100%), 417 (35%)
V-21	381 (100%), 383 (35%)
V-22	415 (100%), 417 (70%), 419 (15%)
V-62	399 (100%), 401 (40%)
V-192	411 (100%), 413 (60%)
V-202	395 (100%), 397 (80%)
VI-1	410 (100%)
VI-22	478 (100%), 480 (70%), 482 (15%)

VI-62	462 (100%), 464 (30%)
VI-101	488 (100%), 490 (100%)
VI-202	458 (100%), 460 (30%)
IX-62	435 (100%), 437 (40%)
X-22	459 (100%), 461 (75%), 463 (15%)
X-62	443 (100%), 445 (40%)
XI-62	467 (100%), 469 (40%)
XII-22	478 (100%), 480 (75%), 482 (35%), 484 (5%)
XIII-22	471 (100%), 473 (70%), 475 (15%)
XIII-62	455 (100%), 457 (35%)

XIV-22	451 (100%), 453 (70%), 455 (15%)
XV-22	528 (100%), 530 (70%), 532 (10%)
XVII-62	533 (100%), 535 (40%)
XVIII-22	555 (100%), 557 (80%), 559 (20%)
XVIII-202	535 (100%), 537 (40%)
XIX-22	502 (100%), 504 (70%), 506 (10%)
XIX-202	482 (100%), 484 (40%)
XX-22	521 (100%), 523 (75%), 525 (15%)
XX-62	505 (100%), 507 (40%)
XXI-22	557 (100%), 559 (70%), 561 (15%)

XXI-62	541 (100%), 543 (40%)
XXII-22	526 (100%), 528 (97%), 530 (30%), 532 (5%)
XXV-62	357 (100%), 359 (55%)
XXV-222	363 (100%), 365 (30%)
XXVI-1	460 (100%), 462 (100%)
XXVI-2	494 (100%), 496 (100%), 498 (20%)
XXVI-22	528 (100%), 530 (97%), 532 (30%), 534 (5%)
XXVIII-7	523 (100%), 525 (80%), 527 (20%)
XXVIII-27	519 (100%), 521 (40%)
XXVIII-42	565 (100%), 567 (40%)

XXVIII-67	495 (100%), 497 (70%), 499 (10%)
XXVIII-97	502 (100%), 504 (70%), 506 (10%)
XXVIII-132	503 (100%), 505 (40%)
XXVIII-162	537 (100%), 539 (40%)
XXVIII-187	589 (95%), 591 (100%), 593 (40%), 595 (5%)
XXVIII-217	535 (100%), 537 (70%), 539 (10%)
XXVIII-252	475 (100%), 477 (40%)
XXIX-1	492 (100%), 494 (70%), 496 (15%)
XXIX-7	536 (100%), 538 (70%), 540 (15%)

XXIX-13	476 (100%), 478 (80%), 480 (20%)
XXIX-19	458 (100%), 460 (85%), 462 (15%)
XXIX-31	528 (100%), 530 (97%), 532 (30%), 534 (5%)
XXIX-37	556 (100%), 558 (70%), 560 (15%)
XXIX-43	470 (100%), 472 (100%), 474 (100%), 476 (30%)
XXIX-49	251 (100%), 307 (70%)
XXIX-69	479 (100%), 481 (70%), 483 (15%)
XXIX-75	512 (95%), 514 (100%), 516 (40%), 518 (5%)

XXIX-81	485 (100%), 487 (75%), 489 (20%)
XXIX-87	526 (100%), 528 (70%), 530 (10%)
XXIX-93	536 (100%), 538 (70%), 540 (15%)
XXIX-99	512 (95%), 514 (100%), 516 (30%), 518 (5%)
XXIX-105	560 (100%), 562 (70%), 564 (15%)
XXIX-111	482 (100%), 484 (70%), 486 (15%)
XXIX-117	373 (100%), 375 (70%), 377 (15%), 492 (20%), 494 (15%)

XXIX-123	497 (100%), 499 (75%), 501 (15%)
XXIX-129	469 (100%), 471 (75%), 473 (15%)
XXIX-135	472 (100%), 474 (70%), 476 (15%)
XXIX-141	570 (100%), 572 (75%), 574 (15%)
XXIX-147	532 (100%), 534 (80%), 536 (20%)
XXIX-153	522 (100%), 524 (75%), 526 (15%)
XXIX-159	465 (100%), 467 (40%)
XXIX-165	512 (100%), 514 (40%)
XXIX-171	517 (100%), 519 (40%)

XXIX-177	427 (100%), 496 (80%), 498 (30%)
XXIX-183	467 (100%), 469 (35%)
XXIX-189	463 (100%), 465 (55%), 467 (15%)

XXIX-195	501 (100%), 503 (40%)
XXIX-196	517 (100%), 519 (70%), 521 (15%)
XXIX-201	574 (100%), 576 (80%), 578 (20%)

XXIX-207	489 (100%), 491 (40%)
----------	-----------------------------

表 XXX 至 XXXII 中所選定化合物之質譜數據係使用 LCMS : LC5 : 254nm-10% A 至 100% B 之梯度得到，
A=H₂O+0.01%HCOOH，B=CH₃CN/CH₃OH+0.01%HCOOH，
正電子噴灑 150-1000 m/z。數據示於表 4。

表 4

化合物	mp(°C)	LCMS (滯留時間, 分鐘)	LCMS (M+H)
XXX-1		2'27	465
XXX-2		2'55	562
XXX-3		2'26	465
XXX-4		2'30	497
XXX-5		2'30	497
XXX-6		2'48	562
XXX-7		2'48	594
XXX-8		2'51	594
XXX-9		2'28	473
XXX-10		2'43	570
XXX-11		2'26	522
XXX-12		2'57	686
XXX-13		2'56	596
XXX-14		2'09	528
XXX-15		2'60	718
XXX-16		2'71	630
XXX-17		2'22	560
XXX-18		2'66	686
XXX-19		2'64	596
XXX-20		2'29	528

XXX-21		2'68	718
XXX-22		2'68	630
XXX-23		2'43	589
XXX-24		2'53	621
XXX-25		2'30	562
XXX-26		2'33	562
XXX-27		2'35	594
XXX-28		2'42	594
XXX-29		2'60	638
XXX-30			562
XXX-31			480
XXX-32			546
XXX-33	171 - 172	2'27	449
XXX-34	59 - 61	2'01	415
XXX-35	182 - 184	2'33	512
XXX-36	158 - 160	2'43	506
XXX-37	199 - 201	2'42	506
XXX-38		2'48	546
XXX-39	157 - 159	2'52	546
XXX-40		2'46	546
XXX-41		2'47	520
XXX-42	140 - 142	2'37	556
XXX-43	106 - 110	2'39	506
XXX-44		2'53	546

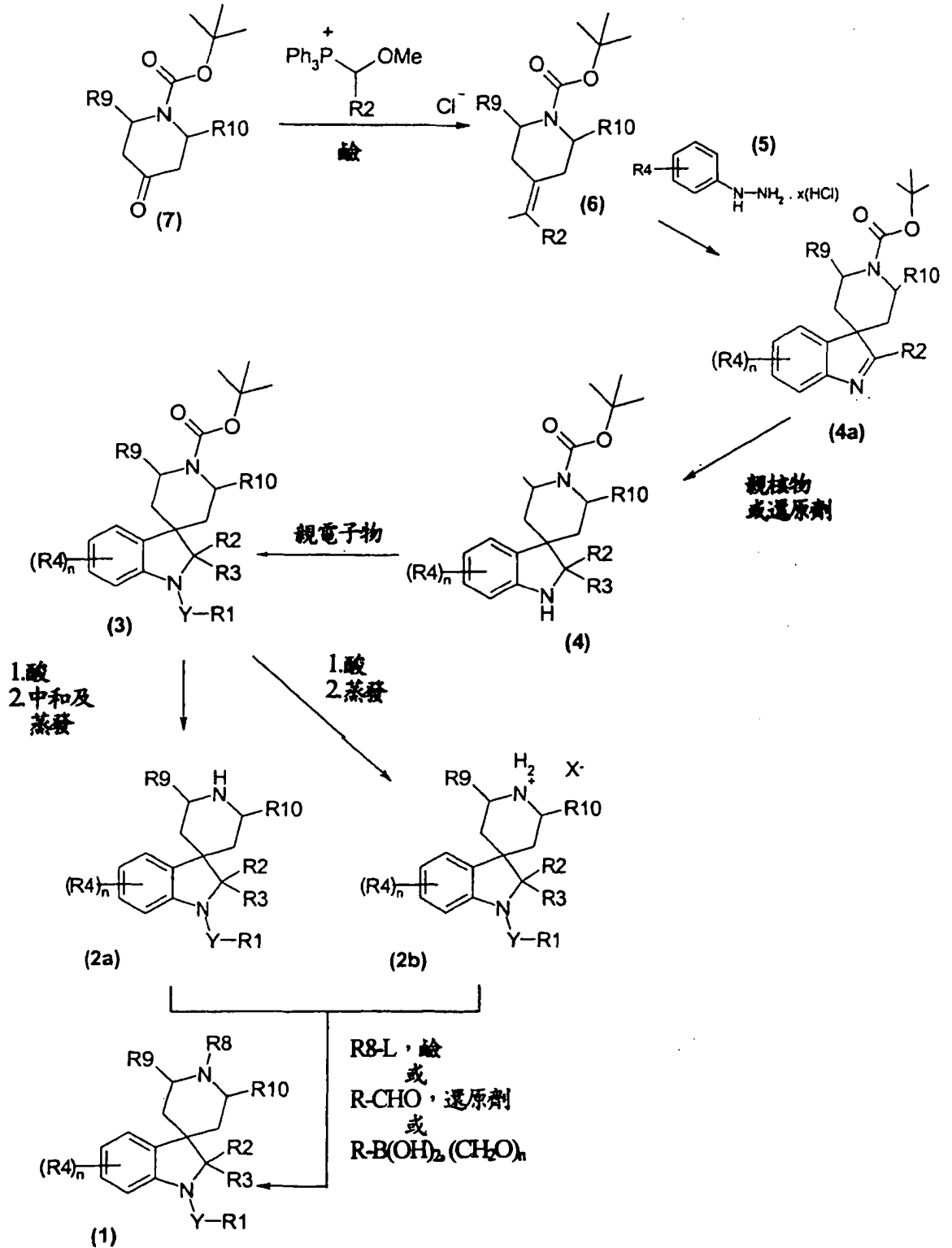
XXX-45	170 - 172	2' 39	546
XXX-46	146 - 148	2' 36	506
XXX-47	196 - 198	2' 31	556
XXX-48	149 - 151	2' 49	534
XXX-49	194 - 196	2' 33	506
XXX-50	165 - 167	2' 48	580
XXX-51			546
XXX-52			504
XXX-53			546
XXX-54			513
XXX-55			523
XXX-56			614
XXX-57			557
XXX-58			522
XXX-59			492
XXX-60			492
XXX-61			531
XXX-62			547
XXX-63			533
XXX-64			557
XXX-65			538
XXX-66			522
XXX-67			513
XXX-68			557
XXX-69			571
XXX-70			503
XXX-71			573
XXX-72			525
XXX-73			557
XXX-74			496
XXX-75			557
XXX-76			547
XXX-77			514
XXX-78			546
XXX-79			538
XXX-80			510
XXX-81			555
XXX-82		2'45	528
XXX-83		2'22	429
XXX-84		2'30	510
XXX-85		2'05	413
XXX-86	70	2'40	562
XXX-87		2'27	465
XXX-88		2'22	497
XXX-89		2'44	530
XXX-90		2'15	433
XXX-91			
XXX-92		2'53	483
XXX-93		1'93	451
XXX-94		1'74	372

XXX-95		2'08	511
XXX-96		1'93	426
XXX-97		2'57	576
XXX-98		1'99	493
XXX-99		2'20	527
XXX-100		2'55	575
XXX-101		2'46	525
XXX-102		1'45	457
XXX-103		2'60	575
XXX-104		2'13	442
XXX-105		1'96	458
XXX-106		1'67	491
XXX-107		1'86	444
XXX-108		1'41	513
XXX-109		1'55	491
XXX-110		2'00	428
XXX-111		1'90	414
XXX-112		2'31	490
XXX-113		2'74	530
XXX-114		2'44	520
XXX-115		2'53	548
XXX-116		2'20	461
XXX-117		2'47	558
XXX-118		2'17	522
XXX-120			399
XXX-121		2'05	427
XXXI-1			547
XXXI-2	147-148		
XXXI-3			484
XXXI-4			528
XXXI-5			504
XXXI-6			535
XXXI-7			539
XXXI-8		1'86	482
XXXII-1			470
XXXII-2			536
XXXII-3			486
XXXII-4			504
XXXII-5			546
XXXII-6			509
XXXII-7			527
XXXII-8			2'27
XXXII-9			1'96
XXXII-10			2'21

正替換頁
95年11月24日

本發明化合物可依多種方式製備。例如：可依反應圖 I 所示反應製備。

反應圖 1



因此，式1化合物之製法可由式2a或2b化合物與式R8-L之烷化劑反應，其中L為氯離子、溴離子、碘離子或磺酸根(例如：甲磺酸根或甲苯磺酸根)或類似脫離基，該反應係於周溫至100°C之溫度範圍內，典型為65°C，於有機溶劑中，如：二氯甲烷、氯仿或1,2-二氯乙烷，於三級胺鹼之存在下，(如：三乙胺或二異丙基乙胺)，可視需要使用鹵化鹽催化(如：碘化鈉、碘化鉀或四丁基銨化碘)進行。

或者，2a或2b化合物可與式RCHO之醛，於周溫至100°C之間，於有機溶劑中(如：四氫呋喃或乙醇或溶劑之混合物)，於還原劑之存在下(如：甲硼烷-吡啶錯合物、氫硼化鈉、(三乙醯氧基)氫硼化鈉、氰基氫硼化鈉，等等)，反應產生式1化合物，其中R8為CH₂-R。

或者，式2a或2b化合物可與多聚甲醛及式R-B(OH)₂二羥硼酸，於周溫與100°C之間，於有機溶劑中(如：乙醇、1,4-二噁烷或水)，反應產生式1化合物，其中R8為CH₂-R。

式2a化合物之製法可由式3化合物與酸(如：三氟乙酸)，於周溫下，於有機溶劑中(如：二氯甲烷、氯仿或1,2-二氯乙烷)反應，然後以有機鹼(如：碳酸鈉、碳酸氫鈉或類似化合物)之水溶液中和反應混合物。

同樣地，式2b化合物之製法可由式3化合物與酸(如：三氟乙酸)，於周溫下，於有機溶劑中(如：二氯甲烷、氯仿或1,2-二氯乙烷)反應，然後蒸發溶劑，與有機溶劑研磨(如：醚或己烷)。

式3化合物之製法可由式4化合物與合適之親電子物反應

。式3中Y為羰基之化合物可由式4化合物與式 $R1-C(O)-Z$ 之羧酸衍生物反應製得，其中Z為氯離子、羥基、烷氧基或醯氧基，該反應係於 $0^{\circ}C$ 至 $150^{\circ}C$ 之間，可視需要於有機溶劑中(如：二氯甲烷、氯仿或1,2-二氯乙烷)，可視需要於三級胺鹼之存在下(如：三乙胺或二異丙基乙胺)，可視需要於偶合劑之存在下(如：二環己基碳化二亞胺)進行。式3中Y為羰基且R1為式 $R'-NH-$ 之胺基酸取代基之化合物製法可由式4化合物與式 $R'-N=C=O$ 異氰酸酯，於類似條件下反應。式3中Y為式 $S(O)_q$ 之基團之化合物製法可由式4化合物於類似條件下，經式 $R1-S(O)_q-Cl$ 化合物處理製得。式3中Y為硫羰基且R1為式 $R'-NH-$ 之胺基取代基之化合物製法可由式3化合物與式 $R'-N=C=S$ 異硫氰酸酯於類似條件下反應。或者，式3中Y為硫羰基且R1為碳取代基之化合物製法可由式3化合物與式3中Y為羰基且R1為碳取代基之化合物經合適硫羰酸劑(如：勞森氏劑(Lawesson's reagent))處理而得。

上述製法中，式 $R1-C(O)-Z$ 之酸衍生物、式 $R'-N=C=O$ 異氰酸酯、式 $R'-N=C=S$ 異硫氰酸酯與式 $R1-S(O)_q-Cl$ 之硫親電子物為已知化合物或可由已知化合物，依相關技藝已知之方式形成。

式4化合物之製法可由式5化合物與式6化合物，於 $0^{\circ}C$ 至 $100^{\circ}C$ 之間，於有機溶劑中(如：二氯甲烷、氯仿或1,2-二氯乙烷)，於酸(如：鹽酸或三氟乙酸)與共溶劑(如：水、甲醇或乙醇)之存在下或於路易斯酸金屬鹽(如：二鹵化鋅(II))之存在下反應。所形成之中間物(式4a化合物)隨後再經親核

物R³-M處理(其中M為金屬物質。R³-M為例如：格林納式劑(Grignard reagent))，或當R³為氫時，經還原劑(如：氫硼化鈉、氫硼化鈉、(三乙醯氧基)氫硼化鈉、氰基氫硼化鈉，等等)，於周溫下，於有機溶劑中(如：乙醇或氯仿)處理。其基本製程說明於Tetrahedron (1997), 53, 10983-10992。

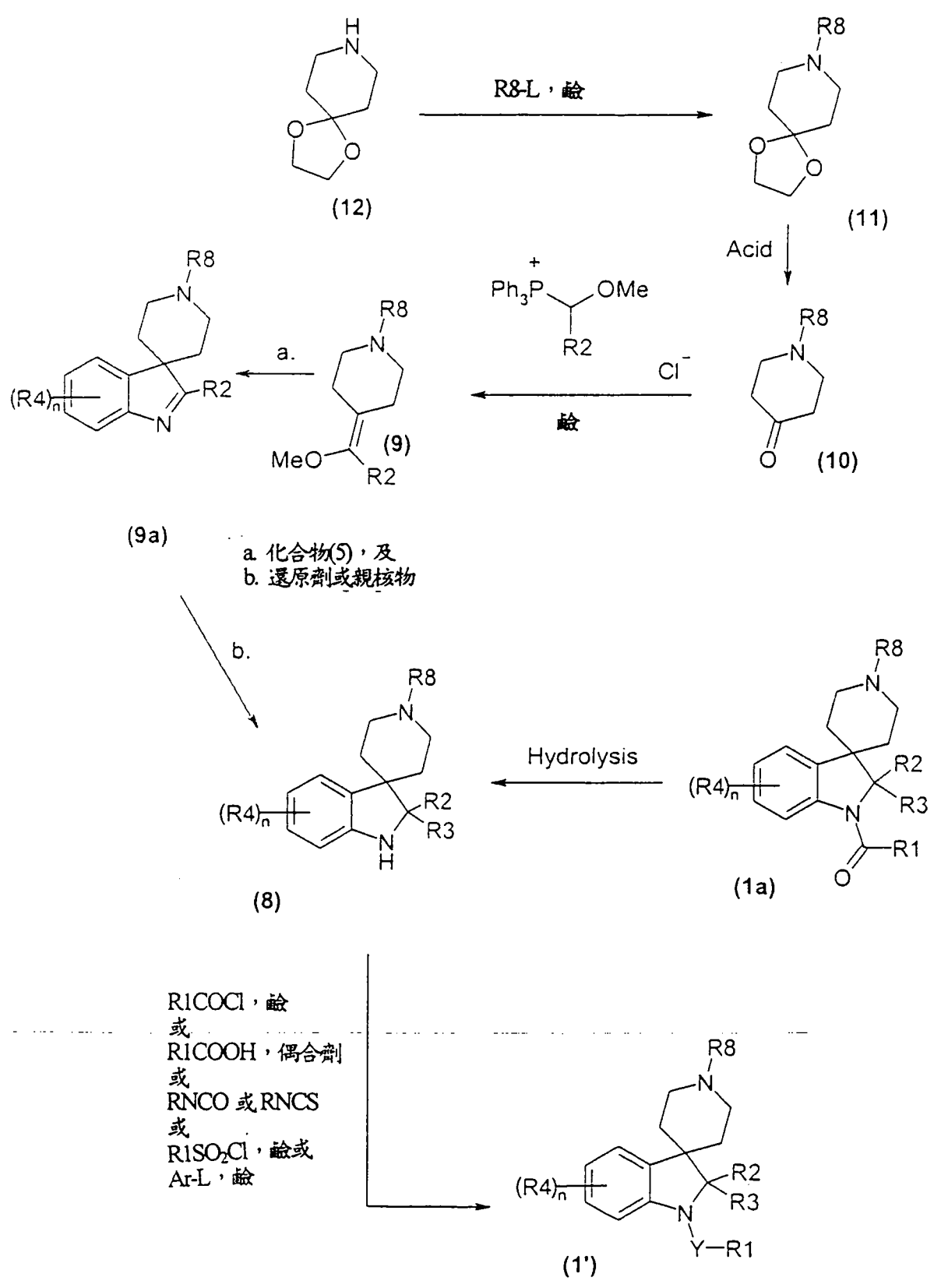
式6化合物製法可由式7化合物與1-烷氧基取代之磷鹽(如：甲氧甲基(三苯基)磷化氯與鹼(如：第三丁醇鉀)，於0°C至室溫下，於四氫呋喃中反應。

式5與7化合物為已知化合物或可依已知技術製備。

某些式2、3、4、4a與6化合物為新穎化合物且形成本發明另一方面。

式I'化合物(式I中R²、R³、R⁹與R¹⁰均為氫之化合物)均說明於下列反應圖II中。

反應圖 II



a. 化合物(5), 及
b. 還原劑或親核物

$RICl$, 鹼
或
 $RICOOH$, 偶合劑
或
 $RNCO$ 或 $RNCS$
或
 $RISO_2Cl$, 鹼或
 $Ar-L$, 鹼

因此，式I'化合物製法可由式8化合物與醯基氯或式R1COCl氯仿，於0°C至周溫下，於有機溶劑中(如：二氯甲烷、氯仿或1,2-二氯乙烷)，於三級胺鹼之存在下(如：三乙胺或二異丙基乙胺)反應。

或者，式I'化合物製法可由式8化合物與式R1COOH之羧酸與標準偶合劑(如：2-氯-1,3-二甲基-2-咪唑啉鎊六氟磷酸鹽)或碳化二亞胺試劑(如：二環己基碳化二亞胺或1-(3-二甲胺丙基)-3-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽，於0°C至周溫下，於有機溶劑中(如：二氯甲烷或四氫呋喃)，於三級胺鹼之存在下(如：三乙胺或二異丙基乙胺)反應。

式I'化合物之製法或可由式8化合物分別與式RNCO或RNCS之異氰酸酯或異硫氰酸酯，於0°C至周溫下，於有機溶劑中(如：二氯甲烷或四氫呋喃)，可視需要於三級胺鹼之存在下(如：三乙胺或二異丙基乙胺)反應。

式I'化合物之製法亦可由式8化合物與式RISO₂Cl磺醯氯，於0°C至周溫下，於有機溶劑中(如：二氯甲烷或四氫呋喃)，於三級胺鹼之存在下(如：三乙胺或二異丙基乙胺)反應。

或者，式I'化合物製法可由式8化合物與式Ar-L芳基或雜芳基化合物反應，其中L為脫離基如：鹵離子(尤指氟離子)，如：2-鹵吡啶、2-鹵嘧啶、4-鹵吡啶、2-鹵吡嘞，等等，其係於50°C至150°C之間，於溶劑中(如：二甲亞砜)，於強鹼之存在下(如：氫化鈉)進行。

式8化合物製法可由式9化合物與式5化合物(反應圖I中)

，於周溫至100°C之間，於有機溶劑中(如：二氯甲烷、氯仿或1,2-二氯乙烷)，於酸之存在下(如：三氟乙酸)，典型地反應4至12小時，然後添加還原劑(如：三乙矽烷)，於周溫至100°C下反應至完成為止。

或者，式8化合物製法可由式9化合物與式5化合物，於0°C至100之溫度間，於有機溶劑中(如：二氯甲烷、氯仿或1,2-二氯乙烷)，於酸(如：鹽酸或三氟乙酸)與共溶劑(水或甲醇或乙醇)之存在下，或於或於路易士酸金屬鹽(如：二鹵化鋅(II))之存在下反應。所形成之中間物(式9a化合物)隨後再經還原劑(如：氫硼化鈉、(三乙醯氧基)氫硼化鈉、氰基氫硼化鈉，等等)，於周溫下，於有機溶劑中(如：乙醇或氯仿)處理。

式8化合物亦可由式1a化合物(其亦為式1化合物之次族群)水解製得，最好以酸水溶液(典型為6 N鹽酸)，於回流溫度下進行。

式9化合物製法可由式10化合物與甲氧甲基(三苯基)磷化氯或相應溴化物鹽及鹼(如：第三丁醇鉀)，於0°C至周溫下，於四氫吡喃中反應。

式10化合物製法可由式11化合物與酸之水溶液(典型為6 N鹽酸)，於回流溫度下反應。

式11化合物製法可由式12化合物與式R8-L親電子物反應，其中L為氯離子、溴離子、碘離子或磺酸根(例如：甲磺酸根或甲苯磺酸根)或類似脫離基，該反應係於周溫至100°C之溫度範圍內，典型為60°C，於有機溶劑中，如：二氯甲烷、氯仿或1,2-二氯乙烷，於三級胺鹼之存在下(如：

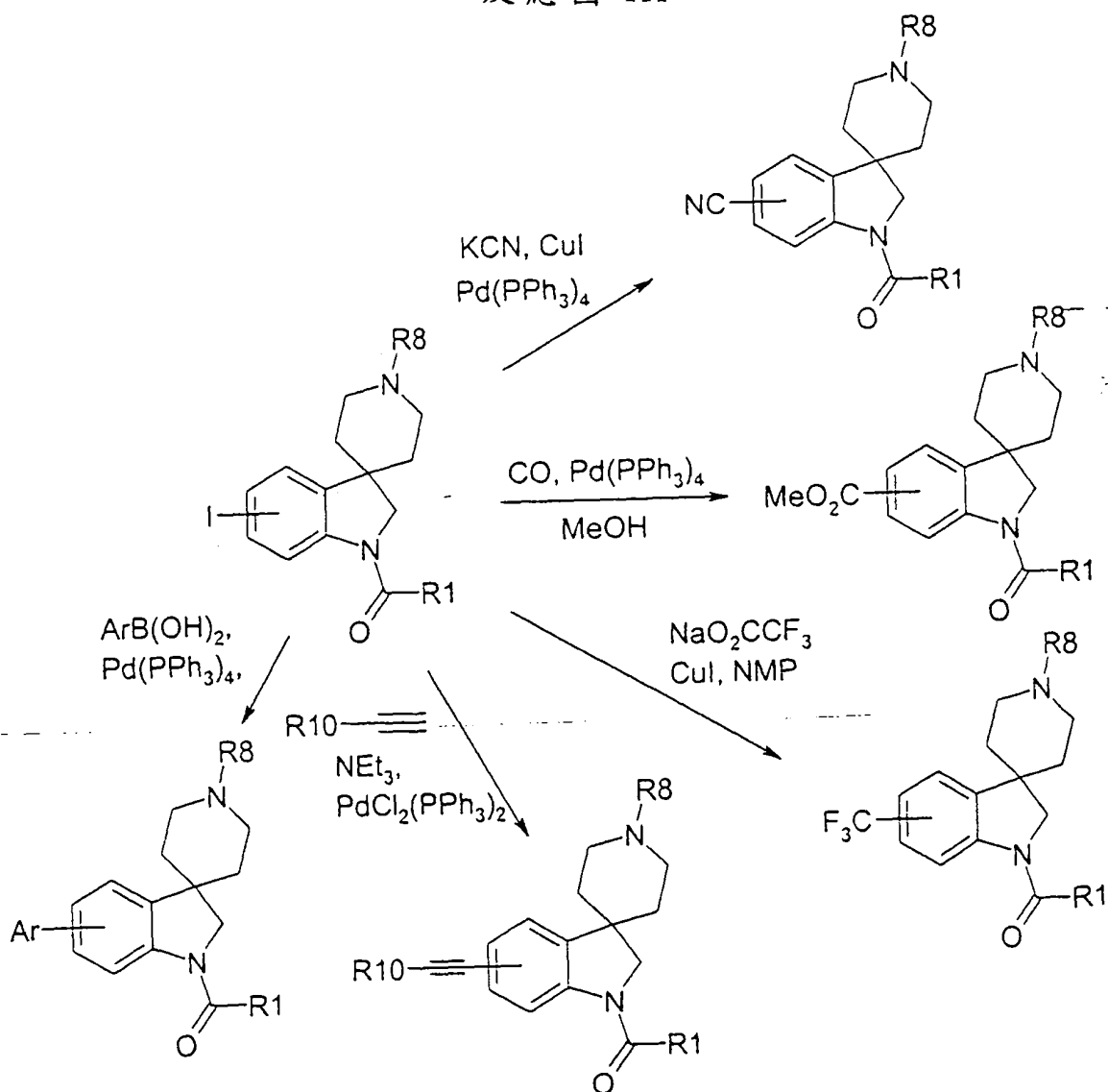
三乙胺或二異丙基乙胺)，可視需要使用鹵化鹽催化(如：碘化鈉、碘化鉀或四丁基銨化碘)進行。

式12化合物為已知化合物或可依已知技術，由已知化合物製得。

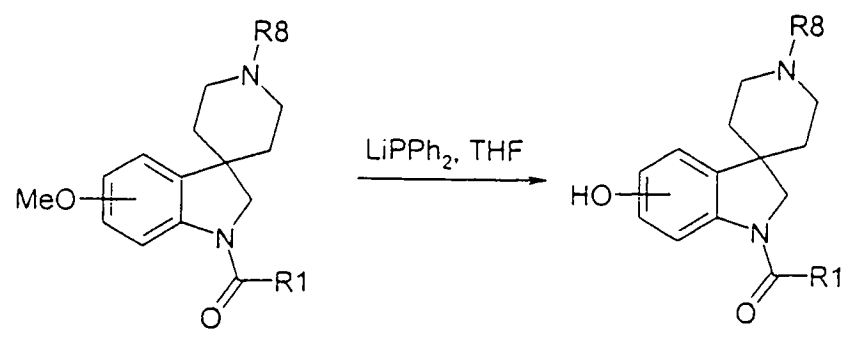
某些式8、9、9a、10與11化合物為新穎化合物且形成本發明另一方面。

習此相關技藝之人士咸了解可使式I化合物轉化成其他式I化合物，此等製法實例示於下列反應圖III、IV、V、Va與VI。

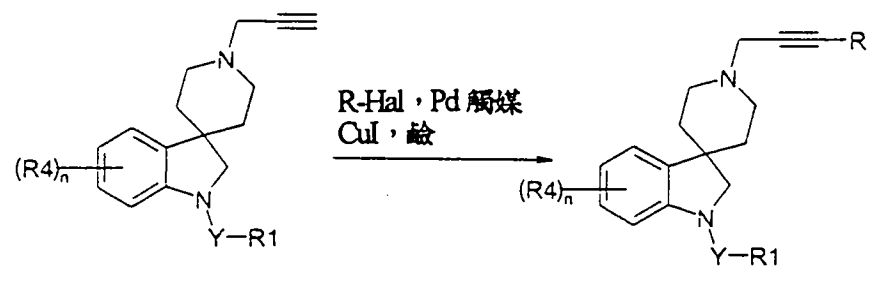
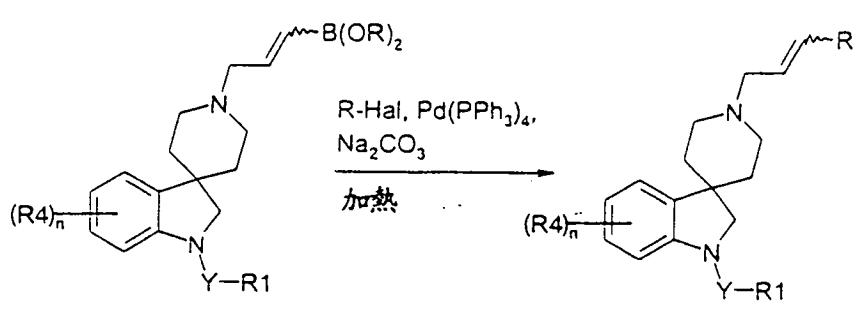
反應圖 III



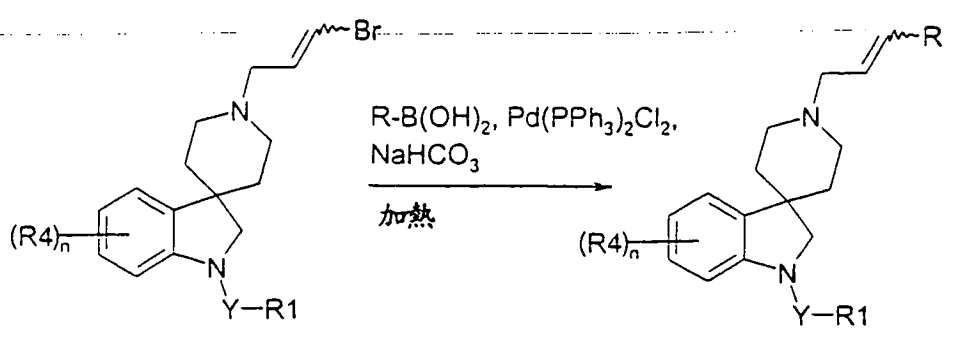
反應圖 IV



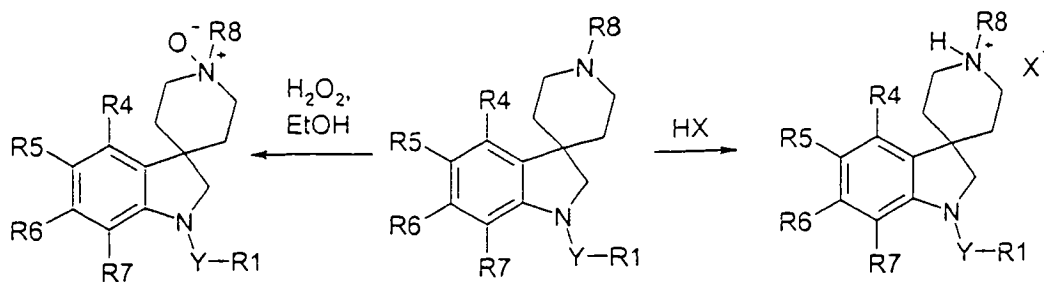
反應圖 V



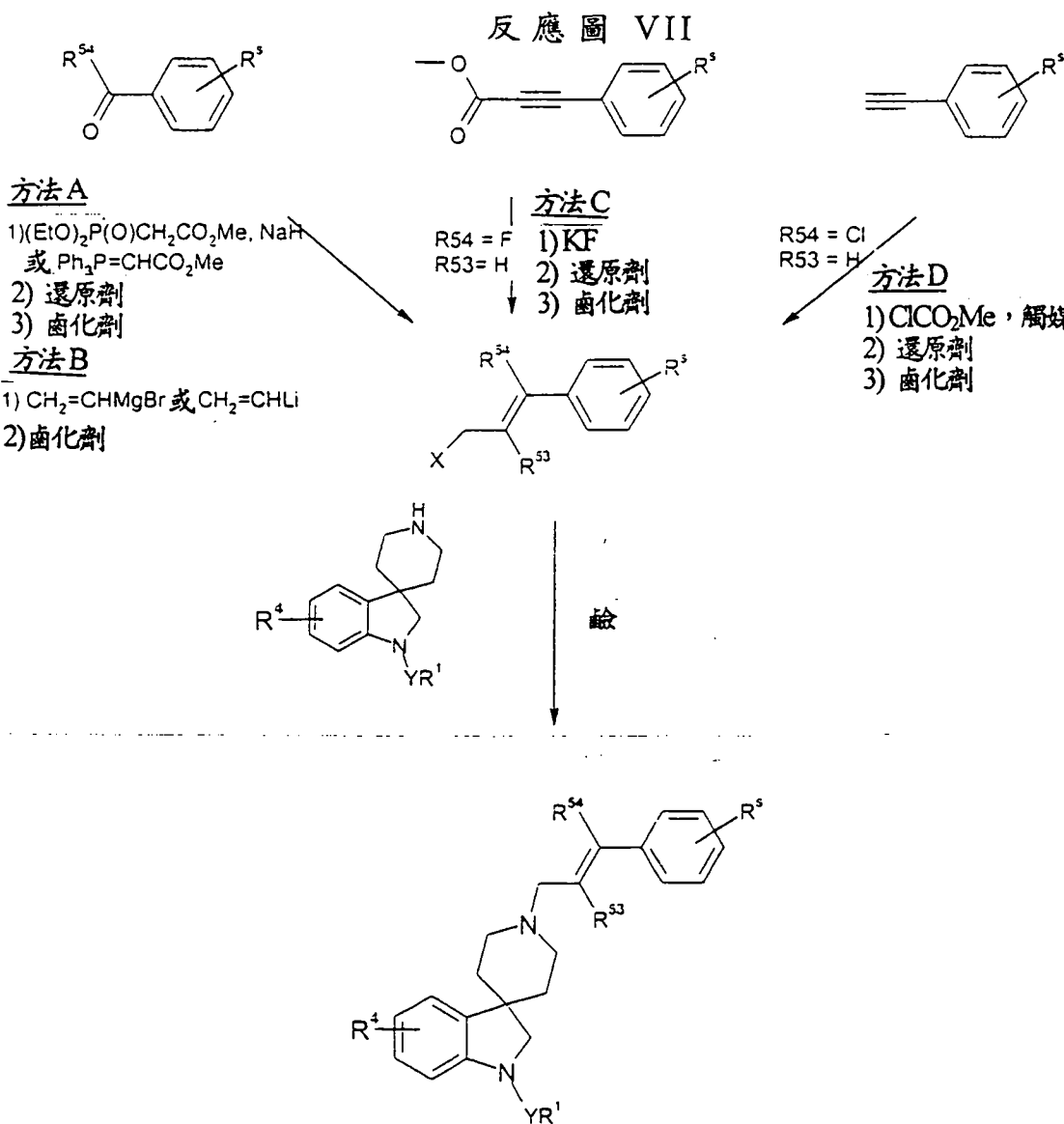
反應 VA



反應圖 VI

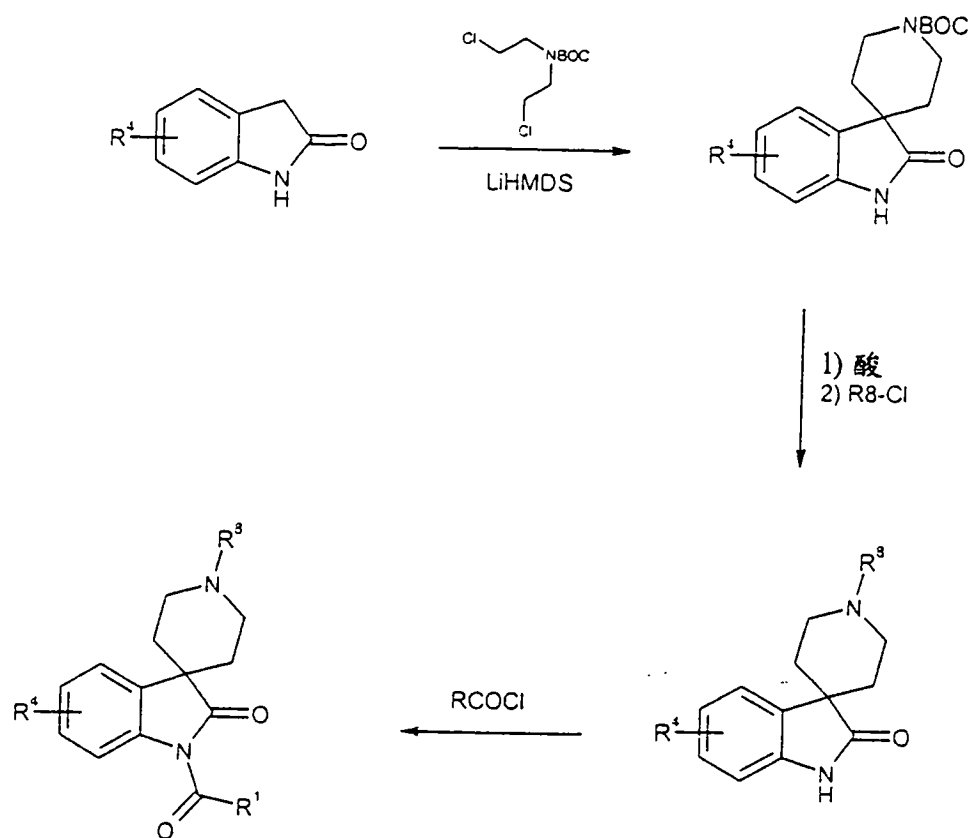


式 I 中 R^8 為可視需要經取代之肉桂基之化合物，可依下列反應圖 VII 製備，其中 R^4 、 R^{53} 、 R^{54} 與 R^5 如上述定義。此反應說明於實例 8-12 中。



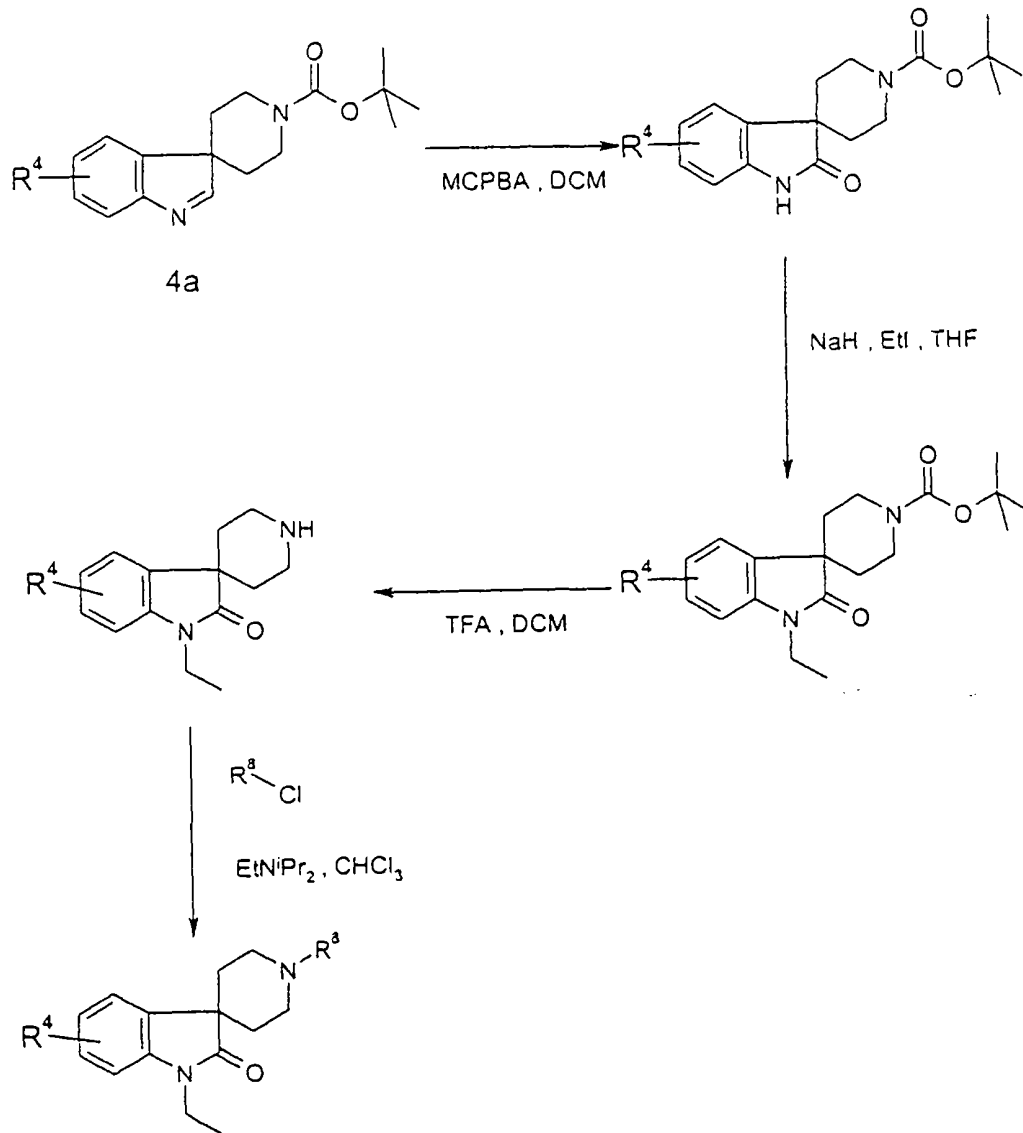
式(I)中 R^2 與 R^3 共同為氧代基且 R^1 、 R^4 與 R^8 如上述定義之化合物可依下列反應VIII所示之WO 0145707之方法製備。

反應圖 VIII



式(I)中 R^2 與 R^3 共同為氧代基且 R^8 如上述定義之化合物可依下列反應IX所示之方法，由式4a化合物製備。

反應圖 IX



式 (I) 化合物可用於防治有害昆蟲 (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) 與等翅目 (Isoptera)) 及其他無脊椎有害生物，例如：蟬蟎、線蟲與軟體動物等有害生物。昆蟲、蟬蟎

、線蟲與軟體動物在下文中統稱為有害生物。可使用本發明化合物防治之有害生物包括彼等與農業(此名詞包括種植與食物及纖維產品有關之作物)、園藝及畜牧、寵物、森林及植物性庫存產品(如：果實、穀粒、與木材)有關之有害生物；彼等與損壞人造結構及與人類及動物之疾病傳染有關之有害生物；及擾人之有害生物(如：跳蚤)。

可使用本發明式(I)化合物防治之有害生物實例包括：
Myzus persicae (蚜蟲)、*Aphis gossypii* (蚜蟲)、*Aphis fabae* (蚜蟲)、*Lygus* spp. (盲蝽)、*Dysdercus* spp. (盲蝽)、*Nilaparvata lugens* (褐飛虱)、*Nephotettix incticeps* (黑尾葉蟬)、*Nezara* spp. (蟻象)、*Euschistus* spp. (蟻象)、*Leptocorisa* spp. (蟻象)、*Frankliniella occidentalis* (薊馬)、*Thrips* spp. (薊馬)、*Leptinotarsa decemlineata* (馬鈴薯象甲)、*Anthonomus grandis* (鈴象甲)、*Aonidiella* spp. (圓蚧)、*Trialeurodes* spp. (粉虱)、*Bemisia tabaci* (粉虱)、*Ostrinia nubilalis* (歐洲玉米螟)、*Spodoptera littoralis* (斜紋夜蛾)、*Heliothis virescens* (菸夜蛾)、*Helicoverpa armigera* (棉夜蛾)、*Helicoverpa zea* (玉米穗夜蛾)、*Sylepta derogate* (棉大捲夜蛾)、*Pieris brassicae* (白粉蝶)、*Plutella xylostella* (小菜蛾)、*Agrotis* spp. (地老虎)、*Chilo suppressalis* (二化螟)、*Locusta migratoria* (飛蝗)、*Chortiocetes terminifera* (飛蝗)、*Diabrotica* spp. (葉甲)、*Panonychus ulmi* (蘋果紅蜘蛛)、*Panonychus citri* (橘金爪蟎)、*Tetranychus urticae* (棉紅蜘蛛)、*Tetranychus cinnabarinus* (朱砂葉蟎)、*Phyllocoptruta*

oleivora (橘銹蟎)、Polyphagotarsonemus latus (側多食跣線蟎)、Brevipalpus spp. (短鬚蟎)、Boophilus microplus (牛蜱)、Dermacentor variabilis(美洲犬蜱)、Ctenocephalides felis (貓蚤)、Liriomyza spp. (潛夜蟲)、Musca domestics (家蠅)、Aedes aegypti (埃及伊蚊)、Anopheles spp. (蚊子)、Culex spp. (蚊子)、Lucillia spp. (麗蠅)、Blattella germanica (蟑螂)、Periplaneta americana (蟑螂)、Blatta Orientalis (蟑螂)、澳白蟻科(Mastotermitidae)之白蟻(例如：Mastotermes spp.)、木白蟻科(Kalotermitidae)之白蟻(例如：Neotermes spp.)、犀白蟻科(Rhinotermitidae)之白蟻(例如：Coptotermes formosanus、Reticulitennes flavipes、R. speratu、R. virginicus、R. hesperus與R. santonensis)及白蟻科(Termitidae)之白蟻(例如：Globitermes sulphureus)、Solenopsis geminata (火蟻)、Monomorium pharaonis(廚蟻)、Damalinea spp.與Linognathūs spp. (蝨)、Meloidogyne spp. (根瘤線蟲)、Globodera spp. 與Heterodera spp. (胞囊線蟲)、Pratylenchus spp. (傷害線蟲)、Rhodopholus spp. (香蕉潛線蟲)、Tylenchulus spp.(橘線蟲)、Haemonchus contortus (標棒線蟲)、Caenorhabditis elegans(醋線蟲)、Trichostrongylus spp. (胃腸線蟲)與Deroceras reticulatum (括輸)。

因此本發明提出一種防治昆蟲、蜱蟎、線蟲或軟體動物之方法，其包括施用殺昆蟲性、殺蜱蟎性、殺線蟲性或殺軟體動物性有效量之式(I)化合物或含式(I)化合物之組合物至有害生物、有害生物之所在地、或容易被有害生物侵害

之植物上。式(I)化合物最好用於對抗昆蟲、蟬蟎或線蟲。

本文中使用之"植物"一詞包括幼苗、灌木與樹木。

為了施用作為殺昆蟲劑、殺蟬蟎劑、殺線蟲劑或殺軟體動物劑之式(I)化合物至有害生物、有害生物之所在地、或容易被有害生物侵害之植物上，式(I)化合物通常調配成組合物，其中除了式(I)化合物外，尚包含合適之惰性稀釋劑或載劑，及可視需要選用之界面活性劑(SFA)。SFA為可以藉由降低界面張力而修飾界面性質(例如：液體/固體、液體/空氣或液體/液體界面)，因此可改變其他性質(例如：勻散性、乳化性與濕化性)之化學物質。所有組合物(包括固體與液體調配物)較佳為包含0.0001至95%式(I)化合物，以1至85%更佳，例如：5至60%。組合物通常用於控制有害生物，因此式(I)化合物之施用率為每公頃0.1 g至10 kg，以1 g至6 kg較佳，以1 g至1 kg更佳。

當用於包覆種子時，式(I)化合物之使用率為每公斤種子使用0.0001 g至10 g(例如：0.001 g或0.05 g)，以0.005 g至10 g較佳，以0.005 g至4 g更佳。

本發明另一方面提供一種殺昆蟲性、殺蟬蟎性、殺線蟲性或殺軟體動物性之組合物，其包含殺昆蟲性、殺蟬蟎性、殺線蟲性或殺軟體動物性有效量之式(I)化合物與合適之載劑或稀釋劑。該組合物為殺昆蟲性、殺蟬蟎性、殺線蟲性或殺軟體動物性組合物較佳。

本發明另一方面提供一種於某地點防治有害生物之方法，其包括使用殺昆蟲性、殺蟬蟎性、殺線蟲性或殺軟體動

物性有效量之式(I)化合物處理該有害生物或有害生物之所在地。式(I)化合物用於對抗昆蟲、蟎或線蟲較佳。

組合物可選自多種調配物型態，包括細粉散劑(DP)、可溶性散劑(SP)、水溶性粒劑(SG)、水勻散性粒劑(WG)、可濕化散劑(WP)、粒劑(GR) (緩釋型或快釋型)、可溶性濃縮物(SL)、油相溶性液體(OL)、超低體積液體(UL)、可乳化濃縮物(EC)、可勻散性濃縮物(DC)、乳液(包括水包油性(EW)與油包水性(EO))、微乳液(ME)、懸浮濃縮液(SC)、氣霧劑、起霧/發煙調配物、膠囊懸浮液(CS)與種子處理調配物。任何情況下選用之調配物型態將依特定用途、式(I)化合物之物理、化學與生物性質而異。

細粉散劑(DP)之製法為混合式(I)化合物與一種或多種固態稀釋劑(例如：天然黏土、高嶺土、葉蠟石、皂土、礬土、蒙脫土、矽藻土(kieselguhr)、白堊、矽藻土(diatomaceous earths)、磷酸鈣(calcium phosphates)、碳酸鈣與碳酸鎂、硫、石灰石、麵粉、滑石與其他有機與無機固態載劑)，並機械碾磨混合物成細粉。

可溶性散劑(SP)之製法為混合式(I)化合物與一種或多種水溶性無機鹽(如：碳酸氫鈉、碳酸鈉或硫酸鎂)或一種或多種水溶性有機固體(如：多醣)，及可視需要選用一種或多種濕化劑、一種或多種勻散劑或該等製劑之混合物，以改善水勻散性/溶解性。然後碾磨混合物成細散劑。亦可使用類似之組合物製成顆粒，形成水溶性粒劑(SG)。

可濕化散劑(WP)之製法為混合式(I)化合物與一種或多種

固態或液態稀釋劑或載劑、一種或多種濕化劑，及較佳者，一種或多種勻散劑，及可視需要選用之一種或多種懸浮劑，以促進勻散於液體中。然後碾磨混合物成細散劑。亦可使用類似之組合物製成顆粒，形成可勻散性粒劑(WG)。

粒劑(GR)可直接由式(I)化合物與一種或多種粉末狀固態稀釋劑或載劑之混合物製成顆粒形成，或由多孔性顆粒材料(如：浮石、矽鎂土、漂白土、矽藻土(kieselguhr、diatomaceous earths)或碾磨之玉米穗軸)預先形成之空白顆粒吸收式(I)化合物(或其於合適製劑中形成之溶液)製成，或由式(I)化合物活性成份(或其於合適製劑中形成之溶液)吸附在硬核心材料上(如：砂石、矽酸鹽、無機碳酸鹽、硫酸或磷酸鹽)，若必要時可乾燥。常用於促進吸收或吸附之製劑包括溶劑(如：脂系與芳香系石油溶劑、醇類、醚類、酮類與酯類)及膠黏劑(如：聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇、糊精、糖類與蔬菜油)。粒劑中亦可包含一種或多種其他添加物(例如：乳化劑、濕化劑或勻散劑)。

可勻散濃縮物(DC)之製法為使活性成份溶於水或有機溶劑中，如：酮、醇或二醇醚。此等溶液可包含界面活性劑(例如：用於改善水稀釋作用或於噴灑槽中防止結晶)。

可乳化濃縮物(EC)或水包油性乳液(EW)之製法為使式(I)化合物溶於有機溶劑中(可視需要包含一種或多種濕化劑、一種或多種乳化劑或該等製劑之混合物)。適用於EC之有機溶劑包括芳香烴(如：烷基苯或烷基萘)，其實例為 SOLVESSO 100、SOLVESSO 150 與 SOLVESSO 200；

SOLVESSO為註冊商標)、酮類(如：環己酮或甲基環己酮)與醇類(如：苯甲醇、糠醇或丁醇)、N-烷基吡咯烷酮(如：N-甲基吡咯烷酮或N-辛基吡咯烷酮)、脂肪酸之二甲基醯胺(如：C₈-C₁₀脂肪酸二甲基醯胺)與氯化烴。EC產物加水時，可自行乳化產生具有充分安定性之乳液，以方便使用適當設備進行噴灑施用。EW之製法涉及由式(I)化合物成份形成液體(若室溫下不呈液態時，可於合理之溫度下熔化，典型地70°C以下)或溶液(溶於適當溶劑中)，然後由所得之液體或溶液於含有一種或多種SFA之水中，於高剪切下乳化，產生乳液。適用於EW之有機溶劑包括蔬菜油、氯化烴(如：氯苯)、芳香烴(如：烷基苯或烷基萘)及其他低水溶性之適當有機溶劑。

微乳液(ME)之製法為混合水與含一種或多種溶劑與一種或多種SFA之混合物，自發性產生熱動力學上安定之各向同性液體調配物。式(I)化合物最初係含在水或溶劑/SFA混合物中。適用於ME之溶劑包括上述EC或EW中所使用之彼等溶劑。ME可為水包油性或油包水性系統(可經由測定導電度來決定為哪一種系統)且適合與水溶性及油溶性農藥於相同調配物中混合。ME適合於水中稀釋，形成微乳液或習知之水包油性乳液。

懸浮濃縮液(SC)可包含式(I)化合物之細碎不可溶固態粒子之水性或非水性懸浮液。SC之製法可利用球磨法或珠磨法，於合適介質中，可視需要使用一種或多種勻散劑碾磨式(I)化合物，製成化合物之細粒懸浮液。組合物中可包含

一種或多種濕化劑，且可包含懸浮劑，以降低粒子之沉降速率。或者，式(I)化合物可經乾磨後，加至含有上述製劑之水中，形成所需終產物。

氣霧劑調配物包含式(I)化合物與合適推進劑(例如：正丁烷)。式(I)化合物亦可溶解或勻散於合適介質中(例如：水或與水相容之液體，如：正丙醇)，產生可用於非加壓之手持式噴灑幫浦中之組合物。

式(I)化合物可於乾物狀態下與燄火製造混合物混合，形成適合於密閉空間中產生含化合物之煙霧之組合物。

膠囊懸浮液(CS)可類似EW調配物之製法製備，但另包括聚合階段，以得到油液滴之水性勻散液，其中各油液滴包埋在聚合物外殼中，其中並包含式(I)化合物與可視需要選用之載劑或稀釋劑。聚合物外殼可利用界面聚縮合反應或凝聚法製成。組合物可控制式(I)化合物之釋出，且可用於處理種子。式(I)化合物亦可於生物可降解性聚合介質中調配，以控制延緩釋出化合物。

組合物可包含一種或多種添加物，以改善組合物之生物效能(例如：改善其於表面上之濕化性，停滯性或分佈性；防止於處理表面上被雨水沖刷；或式(I)化合物之吸收性或移動性)。此等添加物包括界面活性劑、以油類為主之噴灑添加物，例如：某些礦物油或天然植物油(如：大豆油與菜籽油)，及此等物質與其他生物性加強輔劑(可協助或修飾式(I)化合物作用之成分)之混合物。

式(I)化合物亦可調配用於處理種子，例如：形成散劑組

合物，包括處理乾種子之散劑(DS)、水溶性散劑(SS)或處理漿物之水勻散性散劑(WS)，或形成液體組合物，包括可流動性濃縮物(FS)、溶液(LS)或膠囊懸浮液(CS)。DS、SS、WS、FS與LS組合物之製法極類似上述分別說明之DP、SP、WP、SC與DC組合物。處理種子之組合物可包括有助於組合物與種子附著之製劑(例如：礦物油或形成膜之障壁)。

濕化劑、勻散劑與乳化劑可為陽離子性、陰離子性、兩性或非離子性SFA。

合適之陽離子型SFA包括四級銨化合物(例如：鯨蠟基三甲銨化溴)、咪唑啉類與胺鹽。

合適之陰離子型SFA包括脂肪酸之鹼金屬鹽、硫酸之脂系單酯之鹽類(例如：月桂基硫酸酯鈉)、磺酸化芳香系化合物之鹽類(例如：十二烷基苯磺酸鈉、十二烷基苯磺酸鈣、丁基苯磺酸鹽及二異丙基-與三異丙基-苯磺酸鈉之混合物)、醚硫酸鹽、醇醚硫酸鹽(例如：月桂基醚-3-硫酸鈉)、醚羧酸鹽(例如：月桂基醚-3-羧酸鈉)、磷酸酯(由一種或多種脂肪醇與磷酸(主要指單酯)或五氧化磷(主要指二酯)反應產生，例如：月桂基醇與四磷酸之反應產物；此外此等產物亦可乙氧基化)、磺基琥珀酸鹽、鏈烷烴或烯烴磺酸鹽、牛磺酸鹽與木質素磺酸鹽。

合適之兩性型SFA包括甜菜鹼、丙酸鹽與甘胺酸鹽。

合適之非離子型SFA包括伸烷基氧化物(如：環氧乙烷、氧化丙烯、氧化丁烯或其混合物)與脂肪醇(如：油醇或鯨蠟醇)或與烷基酚(如：辛基酚、壬基酚或辛基甲酚)之縮合產

物；衍生自長鏈脂肪酸或己糖醇酸酐之部份酯；該部份酯與環氧乙烷之縮合產物；嵌段聚合物(包含環氧乙烷與氧化丙烯)；烷醇醯胺；簡單酯類(例如：脂肪酸聚乙二醇酯類)；胺氧化物(例如：月桂基二甲基胺氧化物)；及卵磷脂。

合適之懸浮劑包括親水性膠體(如：多醣類、聚乙烯吡咯烷酮或羧甲基纖維素鈉)與膨脹性黏土(如：皂土或矽鎂土)。

式(I)化合物可依施用農藥化合物之任何已知方式施用。例如：其可經調配或不調配，施用至有害生物或有害生物之所在地(如：有害生物之棲習地或容易被有害生物感染之生長中之植物)或該植物之任何部份，包括葉部、莖、分枝、或根部，或於種子播種前施用至種子上，或施用至即將種植或已種植之其他介質中(如：根部周圍土壤、一般土壤、水田中之水或水耕系統)，其係直接噴灑、撒播細粉、浸泡、呈乳霜或糊劑調配物施用，或呈蒸汽施用，或透過組合物(如：粒狀組合物或包裝在水溶性袋子中之組合物)分佈或混合至土壤中或水性環境中施用。

式(I)化合物亦可注射至植物中或使用電動噴灑技術或其他低體積法噴灑在植株上，或利用地面或空中灌溉系統施用。

呈水性製劑使用之組合物(水性溶液或勻散液)通常呈含高比例活性成分之濃縮物形式提供，使用前方添加濃縮物至水中。此等濃縮物可包括DC、SC、EC、EW、ME、SG、SP、WP、WG、與CS，通常要求可長期安定保存，且在

保存後仍可加水形成水性製劑保持均質性一段充分時間，以便利用一般噴灑設備施用。此等水性製劑中之式(I)化合物含量可依使用目的變化(例如：0.0001至10重量%)。

式(I)化合物可與肥料(例如：含氮-、鉀-或磷肥)混合使用。合適之調配物型態包括肥料顆粒。混合物宜包含至多25重量%式(I)化合物。

因此本發明亦提供一種肥料組合物，其包含肥料與式(I)化合物。

本發明組合物可包含其他具有生物活性之化合物，例如：微量營養素或具有殺真菌活性或具有調節植物生長、除草、殺昆蟲、殺蟬蟎或殺線蟲活性之化合物。

式(I)化合物可為組合物中唯一活性成分，或若適當時，可與一種或多種其他活性成分混合使用，如：農藥、殺真菌劑、增效劑、除草劑或植物生長調節劑。其他活性成分可以：提供具備更廣活性範圍或提高其在定點上持續性之組合物；增加或補充式(I)化合物活性(例如：提高作用速度或克服排斥性)；或協助克服或防止對個別成分產生抗性。該特定之其他成分將依組合物計畫之用途而定。合適之農藥實例包括下列：

a) 擬除蟲菊酯類，如：百滅靈(permethrin)、賽滅寧(cypermethrin)、芬化利(fenvalerate)、伊發烈(esfenvalerate)、第滅寧(deltamethrin)、賽洛寧(cyhalothrin)(特定言之 λ -賽洛寧)、必芬靈(bifenthrin)、芬普靈(fenpropathrin)、賽伏靈(cyfluthrin)、特伏靈(tefluthrin)、對魚安全之擬除蟲菊酯

類(例如：特芬普(ethofenprox))、天然除蟲菊酯類、特滅靈(tetramethrin)、s-必拉特靈(bioallethrin)、芬伏靈(fenfluthrin)、百伏靈(prallethrin)或5-苯甲基-3-咪喃甲基-(E)-(1R,3S)-2,2-二甲基-3-(2-氧代硫醇亞烷-3-基甲基)環丙烷羧酸酯；

b)有機磷酸酯類，如：佈飛松(profenofos)、速佈伏(sulprofos)、歐殺松(acephate)、甲基巴拉松(methyl parathion)、甲基谷速松(azinphos-methyl)、甲基地滅松(demeton-s-methyl)、赫丹(heptenophos)、地滅丹(thiometon)、芬滅伏(fenamiphos)、滅克普(monocrotophos)、佈飛松(profenofos)、賽伏斯(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)、芬速隆(fensulfothion)、大福松(fonofos)、福瑞松(phorate)、福辛(phoxim)、甲基比伏斯(pirimiphos-methyl)、乙基比伏斯(pirimiphos-ethyl)、芬特隆(feniyrothion)、伏賽特(fosthiazate)或大利松(diazinon)；

c)胺甲酸酯類(包括芳基胺甲酸酯類)，如：比加普(pirimicarb)、三賽滅(triazamate)、克狄卡(cloethocarb)、克伏爛(carbofuran)、伏特卡(furathiocarb)、依特卡(ethiofencarb)、艾地卡(aldicarb)、賽伏斯(thiofurox)、卡速凡(carbosulfan)、本地卡(bendiocarb)、芬佈卡(fenobucarb)、普速(propoxur)、鈉乃得(methomyl)或歐殺滅(oxamyl)；

d)苯甲醯基脲類，如：二福隆(diflubenzuron)、三福隆

(triflumuron)、赫伏能(hexaflumuron)、伏速能(flufenoxuron)或克速能(chlorfluazuron)；

e)有機錫化合物如：賽赫錫(cyhexatin)、芬佈錫(fenbutatin oxide)或艾克錫(azoringtin)；

f)吡唑類，如：特芬比(tebufenpyrad)與芬普辛(fenpyroximate)；

g)大環內酯，如：艾伏定(avermectins)或米伯黴素(milbemycins)，例如：艾滅定(abamectin)、伊滅定(emamectin)苯甲酸酯、艾滅定(ivermectin)、米伯黴素(milbemycin)、斯必諾賽(spinosad)或艾殺定(azadirachtin)；

h)激素類或費洛蒙；

i)有機氯化合物如：安殺番(endosulfan)、六氯化苯、DDT、氯丹(chlordane)、或地靈(dieldrin)；

j)脞類，如：克地芬(chlordimeform)或三亞蟎(amitraz)；

k)煙薰劑，如：克普靈(chloropicrin)、二氯丙烷、甲基溴或滅丹(metam)；

l)氯菸鹼基化合物，如：伊滅克(imidacloprid)、賽克滅(thiacloprid)、歐殺普(acetamiprid)、尼普爛(nitenpyram)或地滅散(thiamethoxam)；

m)二醯基胼類，如：特佈賽(tebufenozide)、克芬賽(chromafenozide)或滅芬賽(methoxyfenozide)；

n)二苯基醚類，如：地芬爛(diofenolan)或必佈芬(pyriproxifen)；

o)伊得卡(Indoxacarb)；

p) 克芬比 (Chlorfenapyr) ; 或

q) 比特辛 (Pymetrozine) 。

除了上列主要化學類之農藥外，若適合組合物所需用途時，其他具有特別目標之農藥亦可用在組合物中。例如：可針對特定作物選用特定殺昆蟲劑，例如：於稻作中，使用針對鑽心蟲之殺昆蟲劑(如：卡其特(cartap))或針對飛虱之殺昆蟲劑(如：布芬淨(buprofezin))。或者，組合物中亦可包含針對特定昆蟲品種/生命期之殺昆蟲劑與殺蟬蟎劑(例如：殺蟬蟎卵與幼蟲劑，如：克芬辛(clofentezine)、伏本明(flubenzimine)、赫賽斯(hexythiazox)或特狄芬(tetradifon)；殺蟬蟎性活動力抑制劑如：地克(dicofol)或普蓋(propargite)；殺蟬蟎劑如：丙酸溴或二苯乙醇酸氯；或生長調節劑如：如：海美其能(hydramethyion)、克麻淨(cyromazine)、美特靈(methoprene)、克伏速能(chlorfluazuron)或大伏速能(diflubenzuron))。

可包括在本發明組合物中之殺真菌劑實例為：(E)-甲基-2-[2-(2,5-二甲基苯氧基)苯基]-2-甲氧基-亞胺乙醯胺(SSF-129)、4-溴-2-氟基-N,N-二甲基-6-三氟甲基苯並咪唑-1-磺醯胺、 α -[N-(3-氯-2,6-二甲苯基)-2-甲氧基乙醯胺基]- γ -丁內酯、4-氯-2-氟基-N,N-二甲基-5-對甲苯基咪唑-1-磺醯胺(IKF-916,賽達速(cyamidazosulfamid))、3,5-二氯-N-(3-氯-1-乙基-1-甲基-2-氧代丙基)-4-甲基苯醯胺(RH-7281,唑賽滅(zoxamide))、N-烯丙基-4,5-二甲基-2-三甲基矽烷基噻吩-3-羧醯胺(MON65500)、N-(1-氟基-1,2-二甲基丙基)-2-(2,4-二氯

苯氧基)丙醯胺(AC382042)、N-(2-甲氧基-5-吡啶基)-環丙烷
 羧醯胺、艾本索(acibenzolar)(CGA245704)、艾林卡
 (alanycarb)、艾地莫(aldimorph)、艾拉辛(anilazine)、艾康
 唑(azaconazole)、艾斯本(azoxystrobin)、本拉喜(benalaxyl)
 、免賴得(benomyl)、必賽唑(biloxazol)、必坦諾(bitertanol)
 、保米黴素(blasticidin-S)、溴康唑(bromuconazole)、佈必滅
 (bupirimate)、四氯丹(captafol)、蓋普丹(captan)、貝芬替
 (carbendazim)、貝芬替鹽酸鹽、卡布新(carboxin)、卡布滅
 (carpropamid)、卡芬(carvone)、CGA41396、CGA41397、螞
 離丹(chinomethionate)、氯坦尼(chlorothalonil)、氯唑內
 (chlorozolinate)、克拉肯(clozylacon)、含銅化合物如：鹼性
 氯氧化銅(copper oxychloride)、copper oxyquinolate、硫酸銅
 、樹脂酸銅、與波爾多混合物(Bordeaux mixture)、賽莫尼
 (cymoxanil)、賽康唑(cyproconazole)、賽地尼(cyprodinil)、
 狄巴卡(debacarb)、二-2-吡啶基二硫醚1,1'-二氧化物、達克
 芬(dichlofluanid)、達克淨(diclomezine)、達克爛(dicloran)
 、達芬卡(diethofencarb)、達芬康唑(difenoconazole)、達芬
 快(difenzoquat)、達芬靈(diflumetorim)、O,O-二異丙基-S-
 苯甲基硫代磷酸酯、達滅唑(dimefluazole)、達米康唑
 (dimetconazole)、達滅伏(dimethomorph)、達力莫
 (dimethirimol)、達康唑(diniconazole)、定卡(dinocap)、達賽
 龍(dithianon)、十二烷基二甲基銨化氯、得地莫(dodemorph)
 、多寧(dodine)、得快定(dogvadine)、愛地芬(edifenphos)、
 艾普康唑(epoxiconazole)、伊力莫(ethirimol)、(Z)-N-苯甲基

-N([甲基(甲基-硫亞乙基胺基-氧羰基)胺基]硫)- β -丙胺酸
 乙酯、伊達唑(etridiazole)、發賽松(famoxadone)、芬滅松
 (fenamidone) (RPA407213)、芬瑞莫(fenarimol)、芬布康唑
 (fenbuconazole)、芬伏爛(fenfuram)、芬希滅(fenhexamid)
 (KBR2738)、芬克尼(fenpiclonil)、芬普定(fenpropidin)、芬
 普莫(fenpropimorph)、三苯醋錫(fentin acetate)、三苯羥錫
 (fentin hydroxide)、伏本(ferbam)、菲力松(ferimzone)、伏淨
 (fluazinam)、伏索尼(fludioxonil)、伏滅特(flumetover)、伏
 力亞胺(fluoroimide)、伏克康唑(fluquinconazole)、伏拉唑
 (flusilazole)、伏特尼(flutolanil)、伏賽佛(flutriafol)、福爾
 培(folpet)、伏達唑(fuberidazole)、福拉辛(furalaxyl)、伏滅
 達(furametapyr)、克達辛(guazatine)、赫康唑(hexaconazole)
 、羥基異噁唑、海米唑(hymexazole)、伊麻烈(imazalil)、伊
 本康唑(imibenconazole)、伊克定(iminoctadine)、伊克定三
 乙酸鹽、依康唑(ipconazole)、依佈佛斯(iprobenfos)、依普
 同(iprodione)、伊發卡(iprovalicarb)(SZX0722)、胺甲酸異丙
 基丁酯、亞賜圃(isoprothiolane)、賜黴素(kasugamycin)、甲
 基克辛(kresoxim-methyl)、LY 186054、LY211795、LY248908
 、鋅錳乃蒲(mancozeb)、鋅乃蒲(maneb)、滅芬散(mefenoxam)
 、滅本靈(mepanipyrim)、滅普寧(mepronil)、滅達樂
 (metalaxyl)、滅康唑(metconazole)、滅其能(metiram)、滅其
 能鋅鹽、滅絲本(metominostrobin)、麥坦尼(myclobutanil)
 、鐵甲砷酸銨(neoasozin)、二甲基二硫代胺甲酸鎳、異丙基
 硝汰(nitrothal-iso-propyl)、荼里莫(nuarimol)、歐發斯

(ofurace)、有機汞化合物、歐殺(oxadixyl)、歐速能(oxasulfuron)、喹啉酸(oxolinic acid)、喹康唑(oxpoconazole)、嘉得信(oxycarboxin)、比伏唑(pefurazoate)、本康唑(penconazole)、本賽隆(pencycuron)、吩辛(phenazin oxide)、福賽(phosetyl-Al)、磷酸類、苯酞(phthalide)、皮克斯本(picoxystrobin)(ZA1963)、保粒黴素(polyoxin D)、保能(polyram)、撲殺熱(probenazole)、撲克拉(prochloraz)、撲滅酮(procymidone)、撲莫卡(propamocarb)、普克利(propiconazole)、普尼(propineb)、丙酸、普伏斯(pyrazophos)、必芬斯(pyrifenoxy)、必達寧(pyrimethanil)、百快隆(pyroquilon)、百樂喜(pyroxyfur)、百樂靈(pyrrolnitrin)、四級銨化合物、快滅能(quinomethionate)、快速芬(quinoxyfen)、快得淨(quintozene)、司比康唑(sipconazole)(F-155)、五氯苯酚鈉(sodium pentachlorophenate)、速必安(spiroxamine)、鏈黴素(streptomycin)、硫、地康唑(tebuconazole)、地克爛(tecloftalam)、地納辛(tecnazene)、特康唑(tetraconazole)、腐絕(thiabendazole)、地滅安(thifluzamide)、2-(硫代氟基甲硫基)苯並噻唑、甲基多保淨(thiophanate-methyl)、得蔥地(thiram)、地本康唑(timibenconazole)、甲基特克斯(tolclofos-methyl)、特伏能(tolyfluanid)、三泰芬(triadimefon)、三泰隆(triadimenol)、三佈狄(triazbutil)、三唑賽(triazoxide)、三賽唑(tricyclazole)、三狄莫(tridemorph)、三伏辛(trifloxystrobin)(CGA279202)、三伏靈(triforine)、三伏唑(triflumizole)、三狄康唑(triticonazole)、維利黴素

(validamycin A)、維班(vapam)、溫克辛(vinclozolin)、鋅普(zineb)與鋅能(ziram)。

式(I)化合物可與土壤、泥煤或其他根部介質混合，以保護植物對抗來自種子、來自土壤或葉部之真菌疾病。

適用於組合物之增效劑實例包括胡椒基丁醇鹽、賽薩美(sesamex)、賽伏散(safroxan)與十二烷基咪唑。

適合包含在組合物中之除草劑與植物生長調節劑將依計畫之目標與所需效果而定。

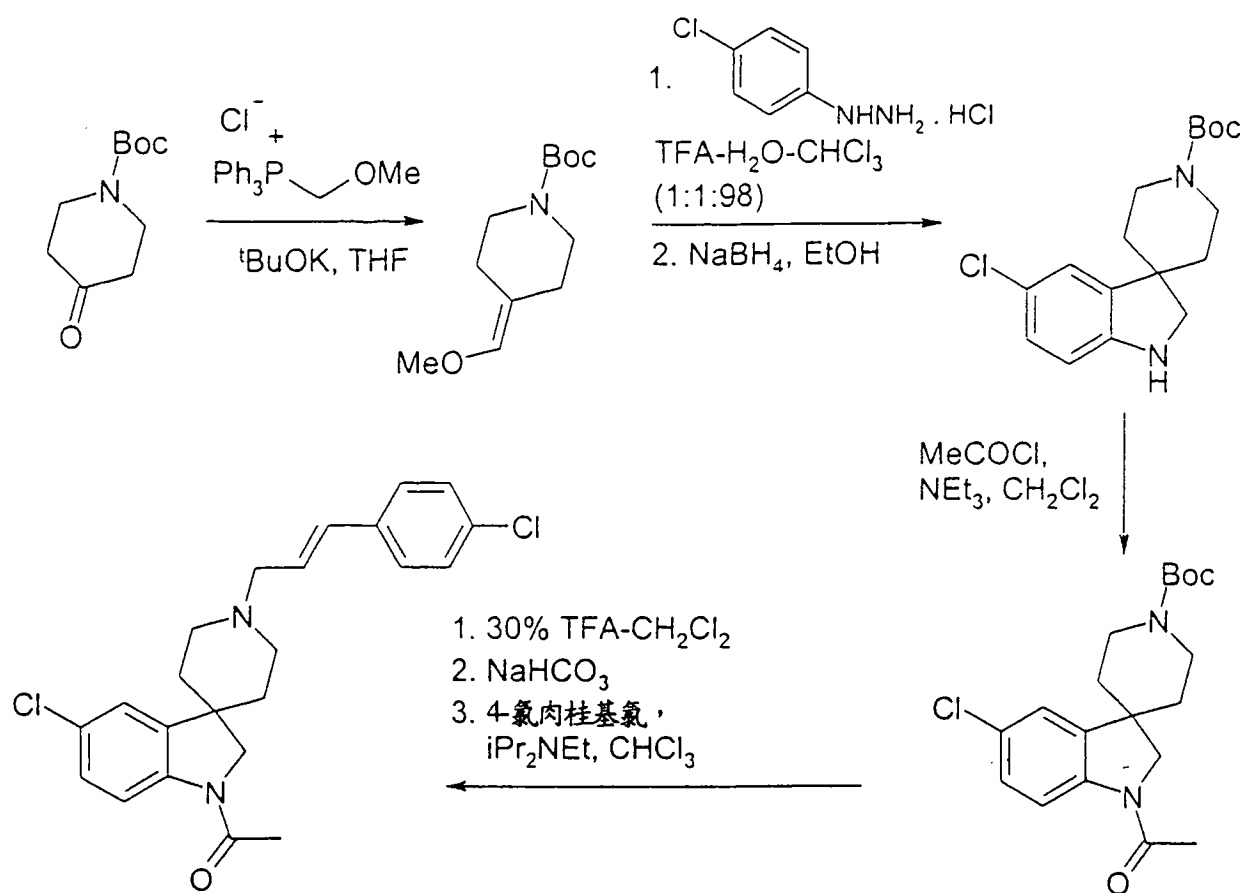
可包含之稻選擇性除草劑實例為除草靈(propanil)。用於棉花之植物生長調節劑實例為PIXTM。

有些混合物可能包括具有顯著不同物理、化學或生物性質之活性成分，以致其不容易融合成同一種傳統之調配物型態。在此等情況下，可製備其他調配物型態。例如：若其中一種活性成分為水不可溶性固體，而另一種為水不可溶性液體時，仍可使各活性成分勻散於同一連續水相中，其係使固體活性成分形成懸浮液(使用類似SC之製劑)，但液體活性成分則呈乳液勻散(使用類似EW之製劑)。所得組合物即為懸浮乳液(SE)調配物。

下列實例說明本發明。

實例 1

本實例說明化合物V-22:1-乙醯基-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]之製法



步驟 1：4-甲氧亞甲基六氫吡啶-1-羧酸第三丁酯之製法

於氮蒙氣與 4°C 下，分批添加第三丁醇鉀 (21.3 g) 至含甲氧甲基三苯基磷化氯 (65.3 g) 之無水 THF (500 ml) 攪拌溶液中。出現鮮橙色，繼續反應 1 小時。在不使溫度上升超過 10°C 下，慢慢添加 4-氧代六氫吡啶-1-羧酸第三丁酯 1 (25 g)，然後使反應混合物回升室溫一夜。

將反應混合物倒至水 (150 ml) 上，以乙酸乙酯 (100 ml) 萃取 3 次，合併之有機層經鹽水 (300 ml) 洗滌，經無水硫酸鈉脫水，真空濃縮，產生褐色油狀物 (50 g)。急驟層析法 [SiO_2 ；己烷，然後乙酸乙酯-己烷 (10:90)]，產生 26.4 g (77%) 所需烯醇醚。 $^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) 1.5 (9H, m), 2.0-2.2

(m, 4H), 3.4 (m, 4H), 3.5 (s, 3H), 5.9 (s, 1H)。MS (ES+) 228 (M+H⁺), 172 (M-異丁烯+H⁺)

步驟 2：5-氯-螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]-1'-羧酸第三丁酯之製法

於氮蒙氣與 4°C 下，添加三氟乙酸 (12 ml) 至含 4-甲氧亞甲基-六氫吡啶-1-羧酸第三丁酯 (12.5 g)、4-氯苯基胍鹽酸鹽 (9.75 g) 與乙醇 (1 ml) 之氯仿 (1200 ml) 攪拌溶液中。混合物於 50°C 下攪拌一夜，轉呈深綠色。添加含於冰水 (500 ml) 中之濃氨水溶液 (200 ml) 中止反應，有機層轉呈橙色。分離有機層，水層再經二氯甲烷萃取 2 次。合併之有機層以鹽水 (300 ml) 洗滌，經無水硫酸鈉脫水及真空濃縮，產生 13 g 亞胺粗產物 5-氯螺[3H-吡啶-3,4'-六氫吡啶]-1'-羧酸第三丁酯 (NMR 測得純度約 80%)。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.5 (9H, m), 1.70 (m, 2H), 1.85 (m, 2H), 3.50 (m, 2H), 4.05 (m, 2H), 7.35 (m, 2H), 7.60 (s, 1H), 8.35 (s, 1H)。MS (ES+) 321/323 (M+H⁺), 265/267 (M-異丁烯+H⁺), 221/223 (M-Boc+H⁺)。

於氮蒙氣下，添加氫硼化鈉 (6.0 g) 至含亞胺粗產物 (12 g) 之無水乙醇 (500 ml) 攪拌溶液中。反應攪拌 15 分鐘，靜置一夜。混合物真空濃縮，殘質再溶於二氯甲烷 (100 ml) 中。有機層經水 (100 ml) 與鹽水 (100 ml) 洗滌，經無水硫酸鈉脫水與真空濃縮，產生褐色固體。急驟層析法 [SiO₂: 乙酸乙酯-己烷-三乙胺 (25:75:1)]，產生 9.8 g (56%，兩個步驟) 所需吡啶。M.p. 165-166°C。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.5 (9H, s), 1.70 (m, 4H), 2.9 (m, 2H), 3.50 (s, 2H), 3.75 (br s, 1H), 4.05

(m, 2H), 6.55 (d, $J = 6\text{ Hz}$, 1H), 7.00 (m, 2H)。MS (ES+) 323/325 ($M+H^+$), 267/269 (M -異丁烯 H^+), 223/225 (M -Boc $+H^+$)。

步驟3：1-乙醯基-5-氯螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]-1'-羧酸第三丁酯之製法

於氮蒙氣下，滴加乙醯氯(2.8 ml)至含5-氯螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]-1'-羧酸第三丁酯(9.8 g)與三乙胺(15 ml)之無水二氯甲烷(400 ml)攪拌溶液中。反應攪拌1小時，然後添加飽和碳酸氫鈉溶液(200 ml)中止反應。有機層經無水硫酸鈉脫水及真空濃縮，產生9.8 g(87%)所需醯胺之灰白色固體。M.p. 64-66°C。 $^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3)，為6:1幾何異構物之混合物。主要幾何異構物 1.5 (9H, s), 1.70 (m, 2H), 1.85 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.85 (m, 2H), 3.90 (s, 2H), 4.2 (m, 2H), 6.97 (d, $J = 1\text{ Hz}$, 1H), 7.20 (dd, $J = 7 \text{ \& } 1\text{ Hz}$, 1H), 8.15 (d, $J = 7\text{ Hz}$, 1H)。次要幾何異構物 1.5 (9H, s), 1.70 (m, 2H), 1.85 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.85 (m, 2H), 4.05 (s, 2H), 4.2 (m, 2H), 7.2 (d, $J = 1\text{ Hz}$, 1H), 7.25 (dd, $J = 7 \text{ \& } 1\text{ Hz}$, 1H), 7.48 (d, $J = 7\text{ Hz}$, 1H)。

步驟4：1-乙醯基-5-氯螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]之製法

於氮蒙氣下，添加三氟乙酸(25 ml)至含1-乙醯基-5-氯螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]-1'-羧酸第三丁酯(8 g)之無水二氯甲烷(250 ml)攪拌溶液中。反應靜置3小時。以飽和碳酸氫鈉溶液(200 ml)洗滌反應，經硫酸鈉脫水及真空濃縮，產生灰白色固體。急驟層析法 [SiO_2 : 甲醇-二氯甲烷-三乙胺 (90:5:5)]，產生5.6 g(61%)所需1-乙醯基-5-氯螺[吡啶啉-3,4'-

六氫吡啶]。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃)為6:1幾何異構物之混合物。主要幾何異構物 1.70 (m, 2H), 1.80 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 2.75 (t, J = 12Hz, 2H), 3.15 (m, 2H), 3.90 (s, 2H), 7.12 (d, J=1Hz, 1H), 7.18 (dd, J = 7 & 1Hz, 1H), 8.15 (d, J =7Hz, 1H)。次要幾何異構物(部份數據) 2.44 (s, 3H), 2.86 (m, 2H), 3.10 (m, 2H), 4.05 (s, 2H)。MS (ES+) 265/267 (M+H⁺)。

步驟5: 1-乙醯基-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]之製法

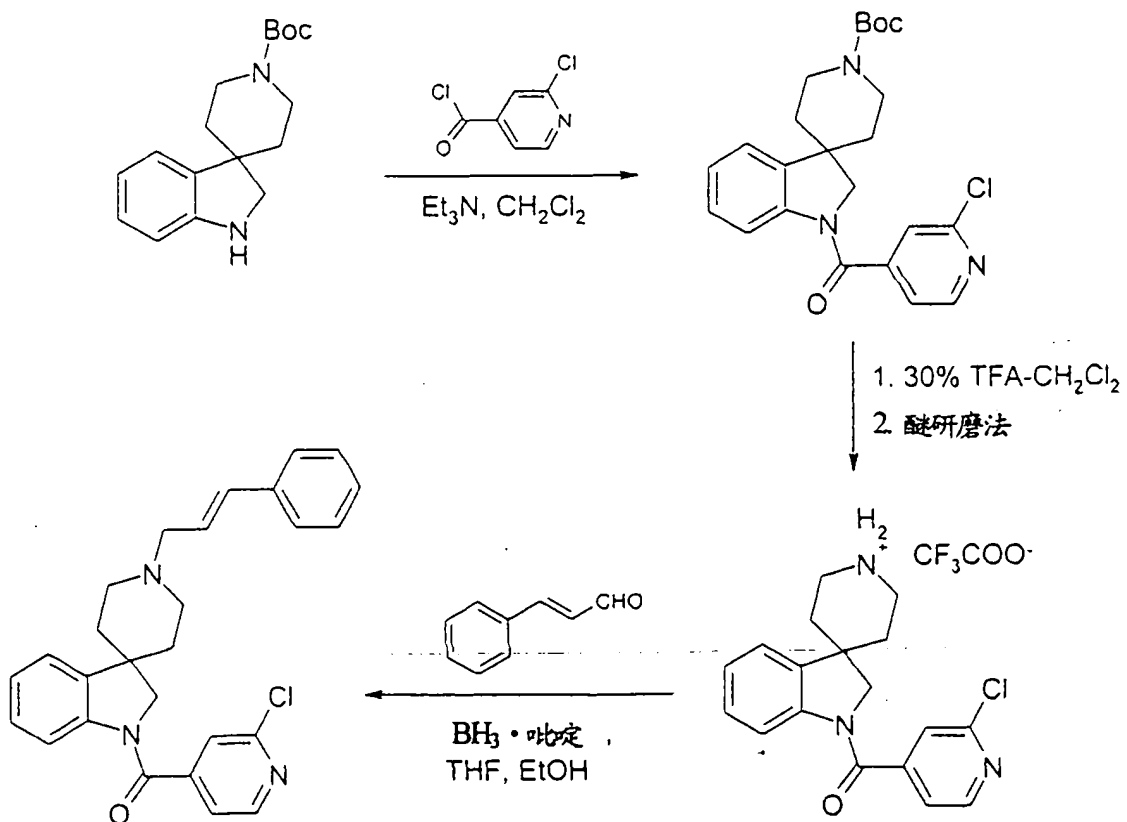
於氮蒙氣與室溫下，慢慢添加含4-氯肉桂基氯(4.0 g)之氯仿(120 ml)溶液至含1-乙醯基-5-氯螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶](5.3 g)與二異丙基乙胺(6.7 ml)之氯仿(120 ml)攪拌混合物中。反應加熱至50°C 30小時。反應混合物真空濃縮，產生紅色油狀物。急驟層析法[SiO₂; 乙酸乙酯-己烷-三乙胺(50:50:1)]，產生5.1 g (68%)所需化合物。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃)為5:1幾何異構物之混合物。主要幾何異構物1.70 (d, J = 12Hz, 2H), 2.0 (td, J = 12 & 2 Hz), 2.08 (t, J= 12 Hz, 2H), 2.25 (s, 3H), 3.03 (d, J = 12Hz, 2H), 3.20 (d, J = 7 Hz, 2H), 3.96 (s, 2H), 6.28(dt, J = 12 & 5Hz, 1H), 6.50 (d, J = 12Hz, 1H), 7.13 (d, J = 1Hz, 1H), 7.18 (dd, J = 7 & 1Hz, 1H), 7.3 (m, 4H), 8.15 (d, J = 7Hz, 1H)。次要幾何異構物(部份數據) 2.42 (s, 3H), 4.00 (s, 2H)。MS (ES+) 415/417/419 (M+H⁺)。

類似上述實例1所述方法，製備化合物II-301, V-21, XXIX-49, V-192, V-62, V-202, XXX-1, XXX-11, XXX1-1,

XXX-18, XXX-12, XXX-13, XXX-14, XXX-15, XXX-16, XXX-17, XXX-18, XXX-19, XXX-2, XXX-20, XXX-21, XXX-22, XXX-23, XXX-24, XXX-25, XXX-26, XXX-27, XXX-28, XXX-29, XXX-3, XXX-4, XXX-5, XXX-6, XXX-7, XXXII-7, XXX-8, XXXI-2, XXXI-8, XXXII-1, XXXII-10, XXXII-2, XXXII-3, XXXII-4, XXXII-5, XXXII-6, XXXII-8 與 XXXII-9。

實例 2

此實例說明化合物 I-1:1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-1'-[反式-3-苯基烯丙基]螺[吲哚啉-3,4'-六氫吡啶]之製法



類似實例 1 步驟 1 與 2 所述之方法製備螺[吲哚啉-3,4'-六氫吡啶]-1'-羧酸第三丁酯。

步驟 1：1-(2-氯吡啶-4-基)羰基螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]-1'-
羧酸第三丁酯

於室溫下，添加亞硫醯氯(20 ml)至2-氯異菸酸(1.2 g)中。添加DMF(2滴)，混合物加熱至回流1小時。蒸發過量亞硫醯氯，殘質溶於二氯甲烷(50 ml)中。添加三乙胺(2 ml)後，滴加含螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]-1'-羧酸第三丁酯(1.7 g)之二氯甲烷(20 ml)溶液。混合物攪拌48 小時。反應混合物經pH 9.4緩衝液(100 ml)洗滌，水層經二氯甲烷萃取。合併之有機層脫水(硫酸鎂)，過濾及蒸發。粗產物經層析法純化[SiO₂；乙酸乙酯-己烷-三乙胺(50:50:1)，提高極性至(100:0:1)]，產生2.4 g (94%)所需醯胺。M.p. 212°C；¹H NMR (400 MHz, d₆-DMSO) 1.50 (s, 9H), 1.6-1.8 (m, 4H), 2.8 (brs, 2H), 3.9 (brs, 2H), 4.08 (d, 2H), 7.0-7.2 (m, 3H), 7.30 (d, J = 6Hz, 1H), 8.43 (d, J = 6Hz, 1H), 7.40 (s, 1H), 8.0-8.2 (br m, 1H)；MS⁺ (ES+) 428/430 (M+H⁺), 372/374 (M+H⁺-異丁烯)。

步驟 2：1-(2-氯吡啶-4-基)羰基螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]三
氟乙酸鹽之製法

添加三氟乙酸(30 ml)含1-(2-氯吡啶-4-基)羰基螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]-1'-羧酸第三丁酯(2.3 g)之無水二氯甲烷溶液(50 ml)中，添加時溶液轉呈深色。反應靜置15 分鐘。反應混合物真空蒸發，此深色殘質再懸浮於無水醚(100 ml)中。殘質研磨至形成自由流動之米色沉澱為止。過濾收集沉澱，於氮氣流下乾燥，產生2.28 g (96%)所需胺鹽。M.p. 245°C (分解)。¹H NMR (400 MHz, d₆-DMSO) 1.8 (m, 2H), 1.9

(m, 2H), 2.9 (m, 2H), 3.25 (m, 2H), 3.98 (s, 2H), 7.15-7.3 (m, 2H), 7.24 (d, $J = 8\text{Hz}$, 1H), 7.56 (d, $J = 7\text{Hz}$, 1H), 7.62 (s, 1H), 8.1 (br s, 1H), 8.56 (d, $J = 7\text{Hz}$, 1H), 8.8 (br s, 2H). MS (ES+) 328/330 ($M+H^+$).

步驟3：1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-1'-[反式-3-苯基烯丙基]螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]之製法

取1-(2-氯吡啶-4-基)羰基螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]三氟乙酸鹽(0.44 g)與反式-肉桂醛(0.29 g)懸浮於四氫呋喃(8 ml)與乙醇(6 ml)中。添加甲硼烷-吡啶錯化物(0.26 ml)，於室溫下激烈攪拌反應一夜。混合物蒸發，分佈在二氯甲烷與水之間。有機層經無水硫酸鎂脫水及真空蒸發。急驟層析法[SiO₂；乙酸乙酯-己烷-三乙胺(25:75:1)，提高極性至(50:50:1)]，產生0.42 g (94%)所需產物。

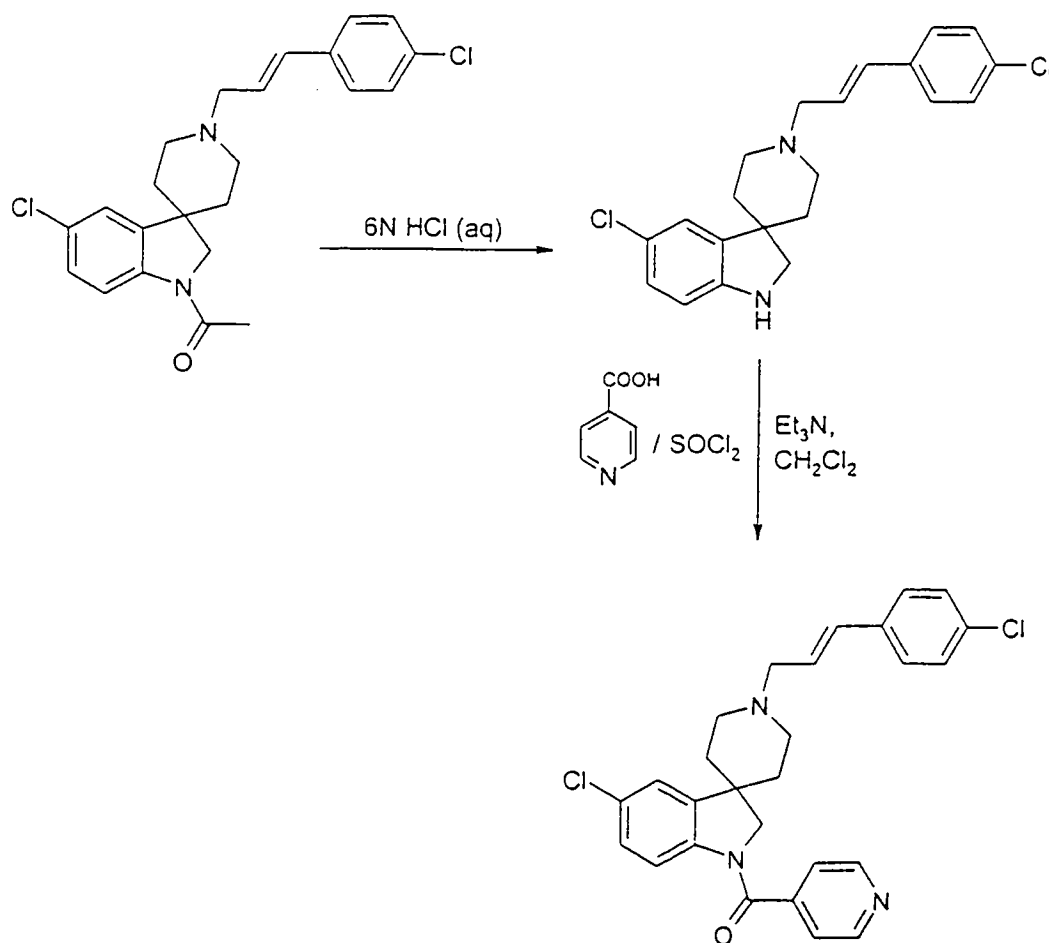
¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) 3:1之幾何異構物混合物。主要幾何異構物 1.70 (m, 2H), 1.8-2.1(m, 4H), 3.0 (m, 2H), 3.20 (m, 2H), 3.75 (m, 2H), 6.3 (m, 1H), 6.52 (d, $J = 12\text{Hz}$, 1H), 7.1-7.4(m, 9H), 7.46 (d, $J = 2\text{Hz}$, 1H), 8.2 (brm, 1H), 8.6 (m, 1H). MS (ES+) 444/446 ($M+H^+$).

類似上述實例2所述方法，製備化合物I-5，I-4，XXIX-7，XXIX-13，I-182，I-142，I-132，XXII-22，VI-I，VI-101，I-22，XXX-96，XXIX-31(以烷化反應作為最終步驟)，XXIX-37(以烷化反應作為最終步驟)，XXIX-43(以烷化反應作為最終步驟)，XXVII-1(隨後經HCl之醚溶液處理)，XXVII-2(隨後經HCl之醚溶液處理)，XXVII-22(隨後經HCl

之醚溶液處理)，XXVI-1(隨後經過氧化氫之甲醇溶液處理)及XXIX-25(以鹼化反應作為最終步驟)。

實例 3

此實例說明化合物 VI-22：1-(吡啶-4-基)-羰基-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]之製法



類似實例 1 所述方法製備 1-乙醯基-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]。

步驟 1：5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]之製法

取 1-乙醯基-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶] (5.0 g) 溶於 6 N 鹽酸 (100 ml) 中加熱至回流 3

小時。混合物冷卻，水層經NaOH固體顆粒鹼化(小心放熱)至pH 12，添加三乙胺(20 ml)。以氯仿萃取混合物3次。有機層經無水硫酸鈉脫水，過濾，真空蒸發，產生褐色油狀粗產物，經管柱層析法純化(SiO₂，乙酸乙酯：己烷：三乙胺。1:1:0.01)，產生3.94 g (88%)所需吲哚啉。MS (ES+) 373/375/377 (M+H⁺)。

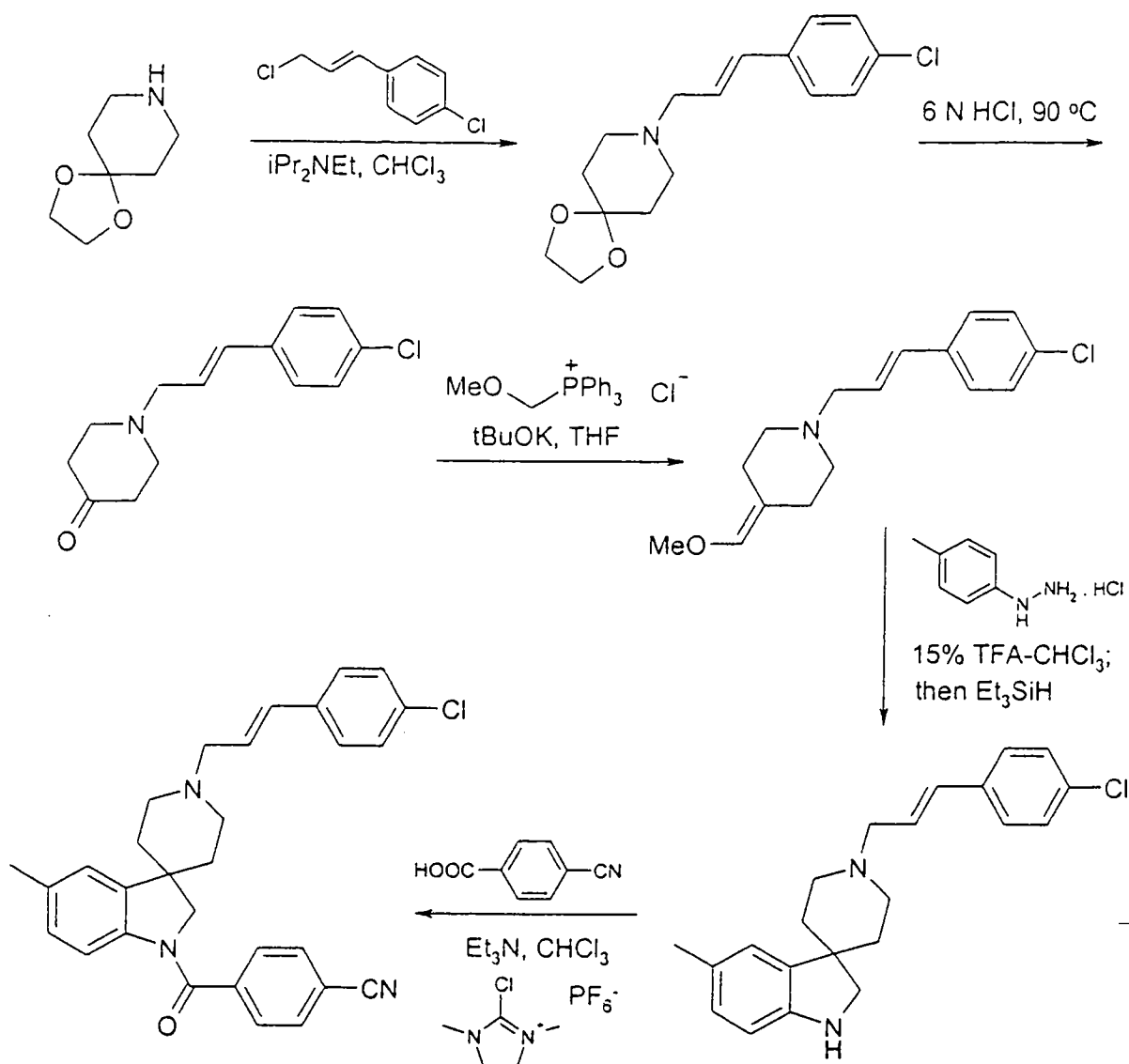
步驟2：1-(吡啶-4-基)羰基-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吲哚啉-3,4'-六氫吡啶]之製法

取異菸酸(0.022 g)與DMF(1滴)溶於亞硫醯氯(2 ml)中，混合物加熱至回流1小時。使混合物冷卻，真空蒸發過量亞硫醯氯。殘質溶於氯仿(4 ml)中，添加三乙胺(0.1 ml)。添加含5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吲哚啉-3,4'-六氫吡啶](0.055 g)之氯仿(1 ml)溶液。反應於室溫下攪拌18小時。添加碳酸鈉水溶液(1 M, 20 ml)，以氯仿(3x 20 ml)萃取混合物。合併之有機層脫水(硫酸鎂)，過濾及真空蒸發，產生褐色油狀粗產物，經層析法純化(SiO₂，乙酸乙酯：己烷：三乙胺0:1:0.01至1:0:0.01)產生0.034 g (49%)所需醯胺。MS (ES+) 478/480/482 (M+H⁺)。

類似上述實例3所述方法，製備化合物XXV-62，I-192，I-202，XXIX-189，VI-202與VI-62。

實例4

此實例說明化合物XIX-202：1-(4-氟基苯甲醯基)-5-甲基-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吲哚啉-3,4'-六氫吡啶]之製法



步驟 1：8-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基-1,4-二氧雜-8-氮雜螺
[4.5]癸烷之製法

取1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸烷(0.88 g)溶於氯仿(5 ml)中，添加二異丙基乙胺(2.1 ml)。添加含4-氯肉桂基氯(1.2 g)之氯仿(2 ml)溶液，混合物加熱至70°C一夜。真空蒸發溶劑，經急驟層析[SiO₂；乙酸乙酯-己烷-三乙胺(50:50:2)]，產生1.38 g(76%)所需縮醛之黃色油狀物。¹H NMR(400 MHz, CDCl₃) 1.78 (t, J = 4 Hz, 4H), 2.60 (br s, 4H), 3.18 (d, J=5

Hz, 2H), 3.96 (s, 4H), 6.27 (dt, $J = 12$ & 5 Hz, 1H) 6.47 (d, $J = 12$ Hz, 2H), 7.28, m, 4H)。MS (ES+) 294/296 $M+H^+$ 。

步驟 2: 1-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]-4-氧代六氫吡啶之製法

取 8-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]-1,4-二氧雜-8-氮雜螺[4.5]癸烷(1.38 g)溶於甲醇(40 ml)中，添加 6N 鹽酸(120 ml)。混合物加熱至回流 4 小時。混合物冷卻，經 NaOH 固體顆粒鹼化(小心放熱)至 pH 14，溶液轉呈不透明。水層經醚萃取 3 次。有機層經鹽水洗滌，經無水 $MgSO_4$ 脫水，蒸發，產生 1.17 g (100%) 所需酮。 1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) 2.38 (m, 4H), 2.70 (m, 4H), 3.15 (d, $J=5$ Hz, 2H), 3.96 (s, 4H), 6.17 (dt, $J = 12$ & 5 Hz, 1H), 6.40 (d, $J=12$ Hz, 1H), 7.20 (m, 4H)。MS (ES+) 250/252 $M+H^+$ 。

步驟 3: 1-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]-4-甲氧亞甲基六氫吡啶之製法

取甲氧甲基三苯基磷化氯(2.4 g)溶於四氫呋喃(20 ml)中，冷卻至 $4^\circ C$ 。添加第三丁醇鉀(0.78 g)，溶液轉呈鮮橙色。反應靜置 30 分鐘。添加含 1-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]-4-氧代六氫吡啶(0.85 g)之四氫呋喃(10 ml)溶液，混合物攪拌 10 分鐘。真空蒸發溶劑，殘質再懸浮於醚中。有機層經水洗滌及經無水硫酸鎂脫水。急驟層析法 [SiO_2 ; 乙酸乙酯-己烷-三乙胺(50:50:2)]，產生 0.85 g (89%) 所需烯醇醚。 1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) 2.10 (t, $J = 6$ Hz, 2H), 2.35 (t, $J = 6$ Hz, 2H), 2.4 (m, 4H), 3.13 (d, $J=5$ Hz, 2H), 3.55 (s, 3H), 5.80 (s, 1H), 6.30 (dt, $J = 11$ & 5 Hz, 1H), 6.45 (d, $J = 11$ Hz, 1H),

7.28 (m, 4H)。MS (ES+) 278/280 (M+H⁺)。

步驟4: 5-甲基-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]之製法

添加三氟乙酸(0.75 ml)至含1-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]-4-甲氧亞甲基六氫吡啶與4-甲苄醯基胍鹽酸鹽(28 mg)之氯仿(5 ml)溶液中，反應加熱至50°C 5小時。添加三乙基矽烷(2 ml)，反應再於50°C下加熱5小時。使混合物冷卻，添加濃氨溶液/碎冰塊(20 ml)中止反應。水層經氯仿萃取2次，合併之有機層經無水硫酸鎂脫水，真空濃縮，產生0.04 g (63%)所需吡啶。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.75 (d, J = 9 Hz, 2H), 1.96 (td, J = 8 & 2, 2H), 2.13 (t, J = 9 Hz, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.95 (d, J = 10 Hz, 2H), 3.19 (d, J = 5 Hz, 2H), 3.42 (s, 2H), 6.30 (dt, J = 11 & 5 Hz, 1H), 6.48 (d, J = 11 Hz, 1H), 6.58 (d, J = 7 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 7 Hz, 1H), 6.9 (s, 1H), 7.30 (m, 4H)。MS (ES+) 353/355 (M+H⁺), 203 (M-4-氯肉桂基+H⁺)。

步驟5: 1-(4-氯苄甲醯基)-5-甲基-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]之製法

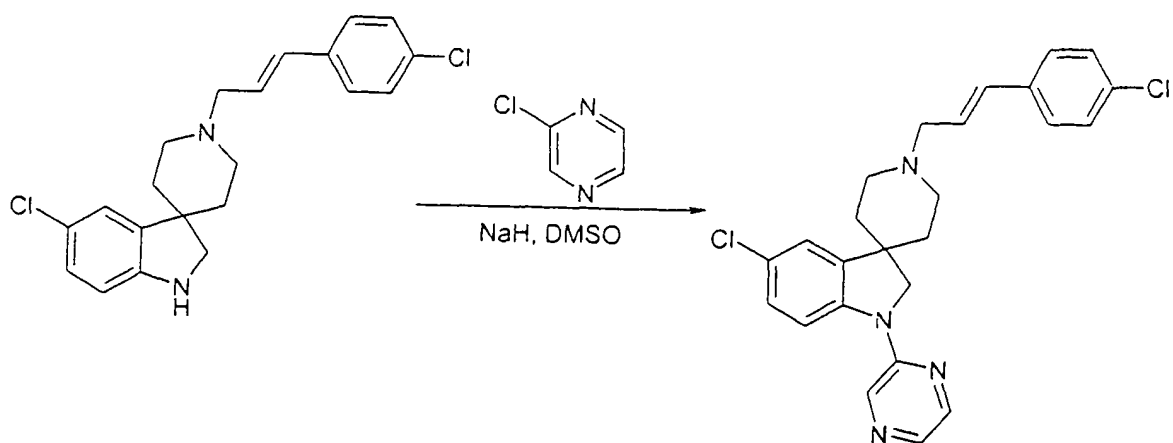
使用 Zymark XP2 合成化學自動儀進行此步驟。添加5-甲基-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]之溶液(2 ml, 取1.43 g溶於100 ml THF中製成)至自動儀試管中，真空排除溶劑。稱取4-氯基苄甲酸(28 mg)加至另一支自動儀試管中。添加2-氯-1,3-二甲基-2-咪唑啉鎘六氟磷酸鹽溶液(2 ml, 取4.80 g溶於180 ml氯仿中製成)與三乙胺溶液(2 ml, 取8.68 ml溶於250 ml氯仿中製成)至酸中，攪拌

試管，靜置30分鐘。添加2 ml酸溶液至含無水胺之試管中。攪拌此試管，靜置一夜。反應混合物經1M碳酸鈉水溶液洗滌，蒸發溶劑。粗產物混合物經MS主導之液相層析法純化，產生所需醃胺，2.9 mg。MS (ES+) 482/484(M+H⁺)。

類似上述實例4所述方法，製備化合物 I-61, I-171, XXVIII-97, XIX-22, XXVIII-67, XXVIII-7, XX-22, XXIX-69, XXIX-75, XVIII-22, XXVIII-217, XXIX-81, XXIX-87, XV-22, XXIX-93, XXIX-99, XXVIII-187, XXI-22, XXIX-105, XXIX-111, XXIX-117, XXIX-123, XIII-22, XXIX-129, X-22, XXIX-135, XXIX-141, XXIX-147, XXIX-153, XII-22, XXIX-196, II-22, XXIX-159, XXVIII-252, XXVIII-27, XXVIII-42, XVIII-202, XX-62, XXIX-165, XXVIII-162, XXVIII-132, XXIX-171, XXIX-177, XXI-62, XVII-62, XIII-62, X-62, XXIX-183, XI-62, IX-62, XXIX-207, XXIX-195, II-62, I-92, I-112, I-12, I-32, I-52, I-72, I-152, I-162, I-82, I-252, I-242, I-262, I-292, I-62 XXX-10, XXX-116, XXX-117, XXX-30, XXX-33, XXX-34, XXX-35, XXX-36, XXX-37, XXX-38, XXX-39, XXX-40, XXX-41, XXX-42, XXX-43, XXX-44, XXX-45, XXX-46, XXX-47, XXX-48, XXX-49, XXX-50, XXX-9與XXX-93。

實例 5

此實例說明化合物 XIV-22：1-(2-吡啶基)-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]之製法



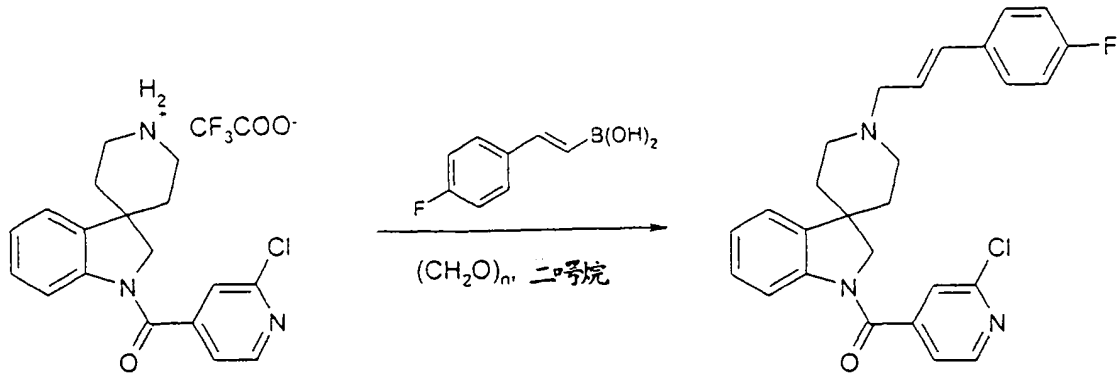
類似上述實例3所述方法，製備5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]。

於氮蒙氣下，添加氫化鈉(50 mg)至含5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶](35 mg)與2-氯吡啶(43 mg)之無水DMSO (5 ml)溶液中。反應加熱至60°C一夜。反應混合物經鹽水(20 ml)稀釋，以二氯甲烷(20 ml)萃取4次。合併之有機層經硫酸鈉脫水，真空濃縮(1 mmHg)，產生褐色油狀物。急驟層析法[SiO₂，乙酸乙酯-己烷-三乙胺梯度(0:98:2)至(98:0:2)]，產生25 mg(55%)所需產物。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 1.75 (m, 2H), 2.05 (td, J = 8 & 2, 2H), 2.18 (t, J = 9 Hz, 2H), 3.05 (d, J = 9 Hz, 2H), 3.22 (d, J = 5 Hz, 2H), 3.94 (s, 2H), 6.30 (dt, J = 11 & 5 Hz, 1H), 6.51 (d, J = 11 Hz, 1H), 7.18 (m, 2H), 7.30 (m, 4H), 8.05 (d, J = 1 Hz, 1H), 8.17(d, J = 6 Hz, 1H), 8.25 (m, 2H). MS (ES+) 451/453/455 M+H⁺。

類似上述實例5所述方法，製備化合物XXIX-57與XXIX-63。

實例 6

此實例說明化合物 XXII-3：1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-1'-[反式-3-(4-氟苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]之製法



類似上述實例 2 所述方法，製備 1-(2-氯吡啶-4-基)羰基螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]三氟乙酸鹽。

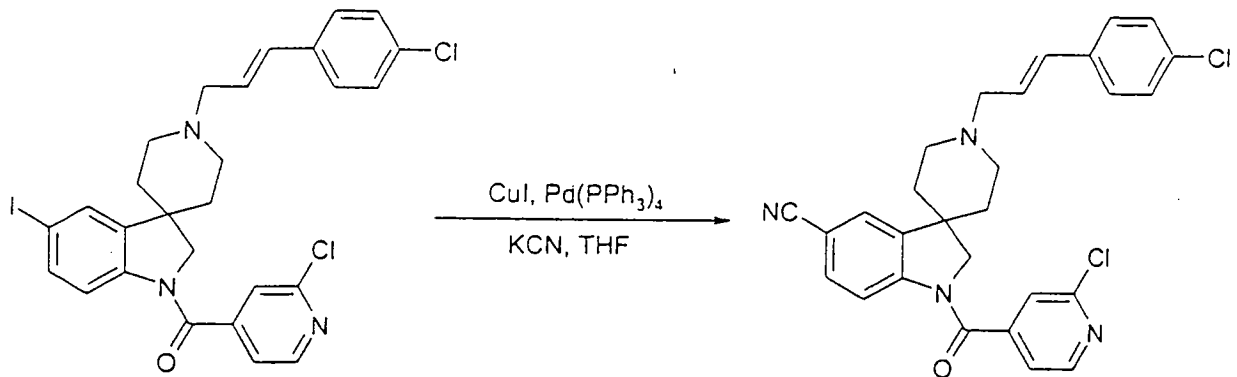
取 1-(2-氯吡啶-4-基)羰基螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]三氟乙酸鹽 (0.25 g) 懸浮於二噁烷 (2 ml) 中，添加多聚甲醛 (0.08 g)。混合物攪拌加熱至 90°C 20 分鐘。取 2-(4-氟苯基)乙烯基二羥硼酸 (0.10 g) 溶於二噁烷 (2 ml) 中，所得溶液加至鹽/多聚甲醛混合物中，所得混合物加熱至 90°C 24 小時。混合物冷卻，真空蒸發至乾。殘質分佈在二氯甲烷與水之間，有機層經碳酸鈉水溶液 (1 M) 洗滌，蒸發。粗產物經管柱層析法純化 (SiO₂，第一隻管柱使用二氯甲烷:三乙胺 95:5，然後第二隻管柱最初使用純二氯甲烷，然後使用乙酸乙酯:己烷:三乙胺之梯度 25:75:1 至 95:0:5)，產生 0.20 g (76%) 所需產物。MS (ES⁺) 462/464 M+H⁺。

類似上述實例 6 所述方法，製備化合物 I-23, XXIX-1, I-21, I-2, XXVI-2 (隨後經過氧化氫之甲醇溶液處理) 與 XXVI-22

(隨後經過氧化氫之甲醇溶液處理)。

實例 7

此實例說明化合物 I-212：5-氰基-1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]之製法



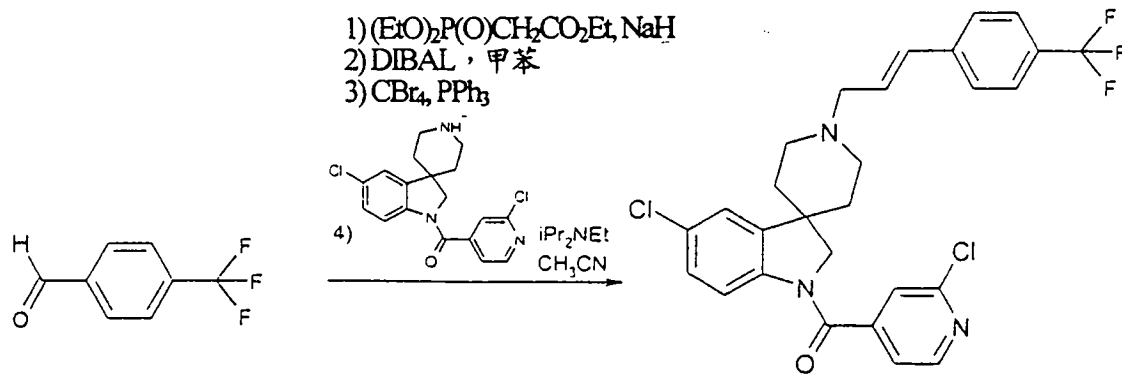
類似上述實例2所述方法，製備5-碘-1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]。

於無水氮蒙氣下，取5-碘-1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶](0.05 g)溶於無水 THF(5 ml)中。添加氰化鉀(0.011 g)與碘化亞銅(I)(0.016 g)，混合物脫氣15分鐘。添加肆-(三苯基膦)鈀(0.005 g)，混合物加熱至回流28小時。反應混合物經二氯甲烷(50 ml)稀釋，以水(30 ml)洗滌。水層經二氯甲烷(2 x 40 ml)萃取，合併之有機層脫水(硫酸鎂)，過濾及真空蒸發，產生無色油狀物，經製備性 TLC 純化(SiO_2 , EtOAc:己烷: Et_3N 1:1:0.01)，產生0.041 g(95%)所需產物。MS (ES+) 503/505/507 $\text{M}+\text{H}^+$ 。

類似上述實例7所述方法，製備化合物XXIX-201，I-282，I-232。以碳酸鉀之甲醇溶液處理化合物XXIX-201，製成化合物XXV-222。化合物XXV-222於標準條件下再醞化，製成化合物I-222。

實例 8

此實例說明化合物XXX-51：1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氯-1'-[(E)-3-(4-三氟甲基-苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氯吡啶]之製法



步驟 1：(E)-3-(4-三氟甲基-苯基)-丙烯酸乙酯之製法

於室溫下，滴加含二乙基亞磷羧基乙酸乙酯(84 g)之1,2-二甲氧乙烷(100 ml)至含氫化鈉(55%油中，15 g)之1,2-二甲氧乙烷(500 ml)懸浮液中。添加4-三氟苯甲醛(43.5 g)之1,2-二甲氧乙烷(100 ml)溶液，所得混合物於室溫下攪拌4小時。加水(400 ml)中止反應，以乙醚(700 ml)稀釋，分離有機相，以鹽水洗滌，經硫酸鈉脫水，及真空濃縮。粗產物自己烷中再結晶，產生37 g所需產物(61%)，經質譜與NMR光譜鑑別特性。

步驟 2：(E)-3-(4-三氟甲基-苯基)-丙-2-烯-1-醇之製法

於0°C下，在含步驟1所得酯(37.1 g)之甲苯(310 ml)溶液中滴加二異丁基鋁氫化物(1.2 M之苯溶液，317 ml)，溶液於0°C下攪拌1小時。於0°C下小心添加水(47.6 ml)，然後添加氫氧化鈉2 M (47.6 ml)，最後添加水(95.1 ml)。混合物於室溫下攪拌1小時。過濾後，溶液經2 N鹽酸、水與鹽水洗滌，經硫酸鈉脫水，真空濃縮，產生29.5 g所需醇之固體(96%)，經質譜與NMR光譜鑑別特性。

步驟3：1-((E)-3-溴-丙烯基)-4-三氟甲基苯之製法

於室溫下，在步驟2所得醇(10 g)之二甲基乙醯胺(100 ml)溶液中添加三苯基膦(23 g)與四溴化碳(29 g)。所得溶液於室溫下攪拌1小時，倒至水中，以乙酸乙酯萃取。有機相經水與鹽水洗滌，經硫酸鈉脫水，經矽膠過濾，產生13 g所需產物之白色固體(95%)，經質譜與NMR光譜鑑別特性。

步驟4：1-(2-氯吡啶-4-基)羧基-5-氯-1'-[(E)-3-(4-三氟甲基-苯基)烯丙基]螺[吡啶-3,4'-六氯吡啶]之製法

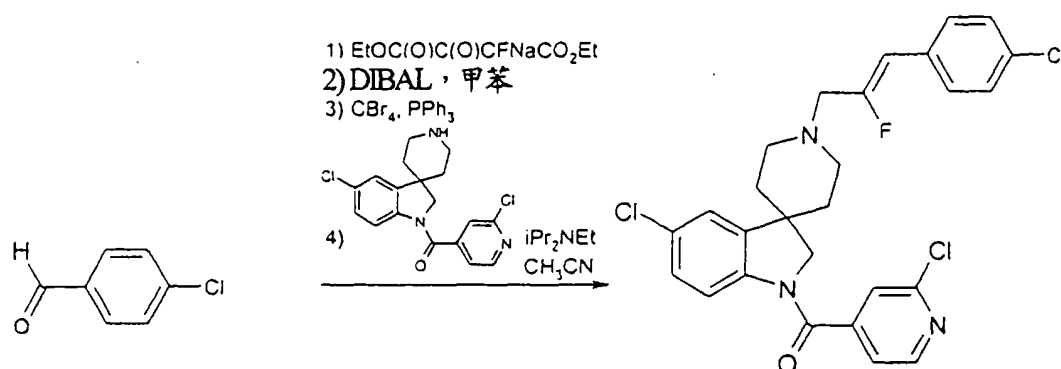
在含1-(2-氯吡啶-4-基)羧基-5-氯-螺[吡啶-3,4'-六氯吡啶](20 g)與二異丙基乙胺(18.2 ml)之乙腈(200 ml)溶液中添加步驟3所得之烯丙基溴(11.6 g)，反應混合物於室溫下攪拌一夜。溶液經乙酸乙酯(200 ml)稀釋，以鹽水(3x100 ml)洗滌，經硫酸鈉脫水，真空濃縮。殘質經管柱層析法純化(SiO₂，乙酸乙酯:己烷:三乙胺95:5:0.1至乙酸乙酯:甲醇:三乙胺95:5:0.1)，產生18.9 g所需產物(82%)。Mp = 130°C。

類似上述實例8所述方法，製備化合物XXX-82，XXX-83

，XXX-84，XXX-85，XXX-86，XXX-87，XXX-91與XXX-92。

實例 9

此實例說明化合物XXX-113：1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氯-1'-[(Z)-3-(4-氯苯基)-2-氟-烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]之製法



步驟 1：(Z)-3-(4-氯-苯基)-2-氟-丙烯酸甲酯之製法

類似：Cousseau, J.等人之Tetrahedron Lett. 1993, 43, 6903之製法，於0°C下，添加4-氯苯甲醛(0.66 g)至含氟草醋酸二乙酯鈉鹽(1 g，由草酸二乙酯、氟乙酸乙酯與氫化鈉依據Alberg等人之J. Am. Chem. Soc. 1992, 3542之方法製備)之四氫吡喃(20 ml)溶液中，所得混合物於0°C下攪拌1小時後，於80°C下3小時。反應混合物真空濃縮，以乙醚稀釋，以碳酸氫鈉水溶液、水與鹽水洗滌，經硫酸鈉脫水，真空濃縮，產生粗殘質(1.2 g)，直接用於下一個步驟。

步驟 2：(Z)-3-(4-氯-苯基)-2-氟-丙-2-烯-1-醇之製法

步驟 3：1-((Z)-3-溴-2-氟-丙烯基)-4-氯-苯之製法

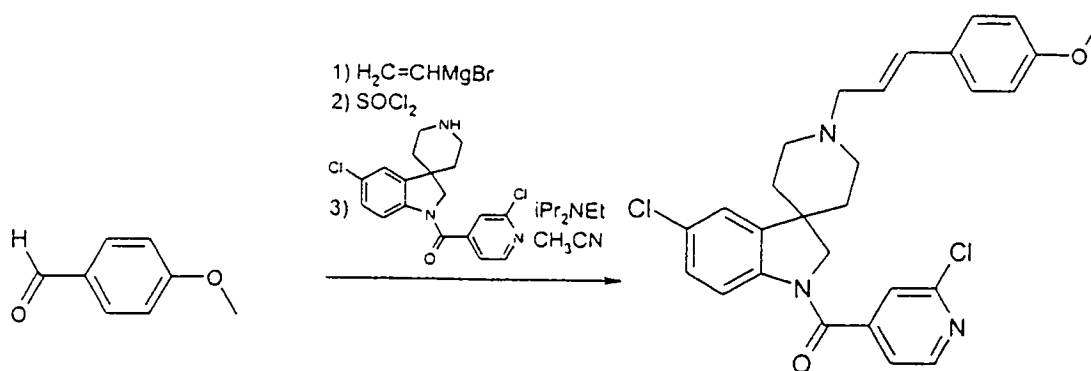
步驟 4：1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氯-1'-[(Z)-3-(4-氯苯基)-2-氟-烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]之製法

步驟2至4係依實例8步驟2-4之方法製備，產生0.17 g所需產物(41%)，經質譜與NMR光譜鑑別特性。MS (ES+) 530。

類似上述實例9所述標準方法，製備化合物XXX-114。

實例 10

此實例說明 I-25：1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氯-1'-[反式-3-(4-甲氧基)烯丙基]螺[吲哚啉-3,4'-六氫吡啶]之製法



步驟1：1-(4-甲氧基-苯基)-丙-2-烯-1-醇之製法

於 -10°C 與氫氣下，在含對茴香醛(1.54 ml)之四氫呋喃(20 ml)溶液中滴加乙烯基鎂化溴(1M之THF溶液，12.5 ml)。於室溫下攪拌溶液一夜，添加飽和氯化銨水溶液(20 ml)中止反應。分離有機相，經硫酸鈉脫水，真空濃縮。殘質經管柱層析法純化(SiO_2 ，乙酸乙酯：環己烷7:3)，產生1.05 g所需產物之無色油狀物(51%)，經質譜與NMR光譜鑑別特性。

步驟2：1-((E)-3-氯-丙烯基)-4-甲氧基-苯之製法

在含步驟1所得烯丙基醇(200 mg)之乙醚(3 ml)溶液中添加亞硫醯氯(0.087 ml)，溶液於室溫下攪拌1小時。溶液真空濃縮，產生221 mg所需產物(100%)之無色固體。Mp =

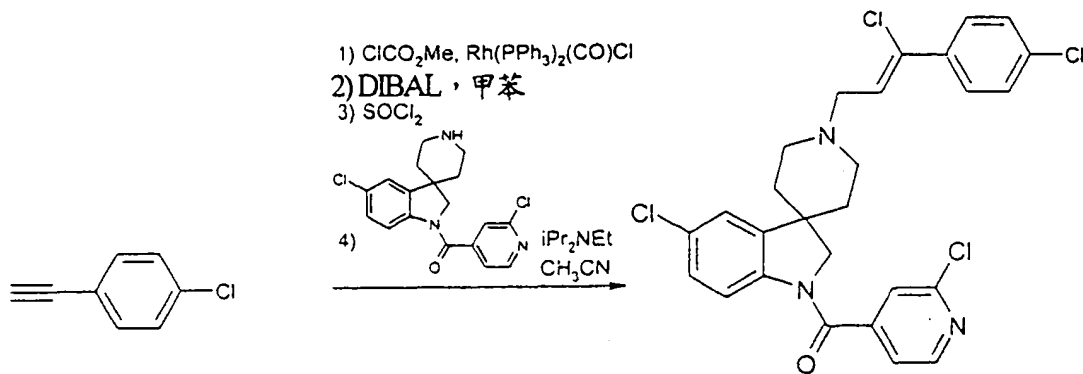
70°C。

步驟3：1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氯-1'-[反式-3-(4-甲氧基-苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]之製法

依實例101步驟4之方法，以步驟2所得1-((E)-3-氯-丙烯基)-4-甲氧基苯(0.22 g)烷化1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氯-螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶](0.43 g)，產生0.36 g標題化合物(59%)，經質譜與NMR光譜鑑別特性。MS (ES+) 509。Mp = 83-85°C。

實例 11

此實例說明XXX-115：1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氯-1'-[(Z)-3-(4-氯苯基)-3-氯-烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]之製法



步驟1：(Z)-3-氯-3-(4-氯-苯基)-丙烯酸甲酯之製法

類似：Tanaka, M.等人之J. Am. Chem. Soc. 1998, 120, 12365在含4-氯苯基乙炔(100 mg)與 $\text{Rh}(\text{CO})(\text{PPh}_3)_2\text{Cl}$ (5 mg)之甲苯(3 ml)溶液中添加氯甲酸甲酯(0.17 ml)，混合物於密封試管中，於110°C下攪拌10小時。反應混合物真空濃縮，經管柱層析法純化(SiO_2 ，乙酸乙酯:環己烷1:9)，產生104 mg

所需產物之褐色固體(61%)，經質譜與NMR光譜鑑別特性。
Mp= 40°C。

步驟2：(Z)-3-氯-3-(4-氯-苯基)-丙-2-烯-1-醇之製法

依實例8步驟2之方法，將(Z)-3-氯-3-(4-氯-苯基)-丙烯酸甲酯(462 mg)轉化成所需產物(391 mg, 96%)，經質譜與NMR光譜鑑別特性。

步驟3：1-氯-4-((Z)-1,3-二氯-丙烯基)-苯之製法

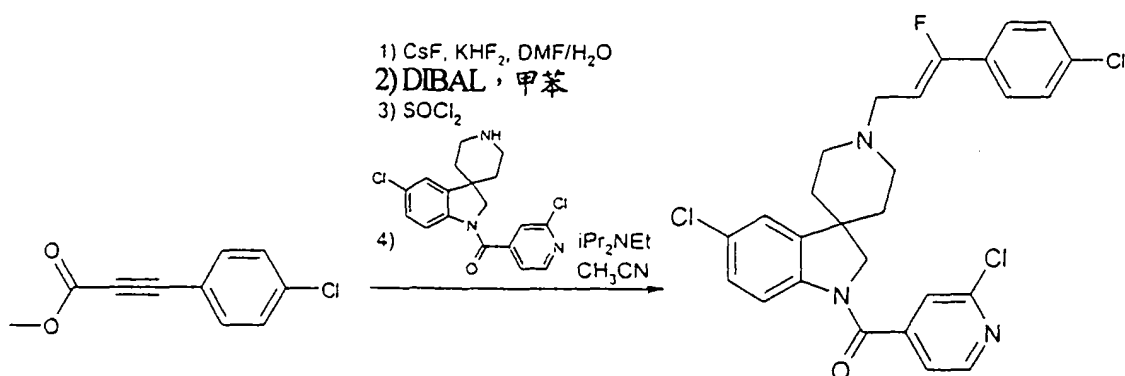
在含(Z)-3-氯-3-(4-氯-苯基)-丙-2-烯-1-醇(101 mg)之甲苯(3 ml)溶液中添加亞硫酸基(0.11 ml)與一滴二甲基甲醯胺。1小時後，溶液真空濃縮，產生120 mg所需烯丙基氯(100%)之無色油狀物。

步驟4：1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氯-1'-[(Z)-3-(4-氯苯基)-3-氯-烯丙基]螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]之製法

依實例101步驟4之方法，以步驟3所得1-氯-4-((Z)-1,3-二氯-丙烯基)-苯(0.11 g)烷化1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氯-螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶](0.18 g)，產生0.17 g標題化合物(64%)之泡沫狀物，經質譜與NMR光譜鑑別特性。MS (ES+) 548。

實例 12

此實例說明XXX-90：1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氯-1'-[(Z)-3-(4-氯苯基)-3-氯-烯丙基]螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]之製法



步驟 1：(Z)-3-(4-氯-苯基)-3-氟-丙烯酸甲酯之製法

類似：Cousseau, J. J. Chem. Soc. Chem. Commun. 1989, 1493之製法，在含(4-氯-苯基)-丙炔酸甲酯(5.36 g)之二甲基甲醯胺(60 ml)溶液中添加含氟化鈉(11.4 g)與氫氟化鉀(2.73 g)之水(5.4 ml)溶液，混合物於80°C下攪拌8小時。反應混合物冷卻至室溫，以乙酸乙酯(50 ml)稀釋，有機相經水(3x50 ml)與鹽水(3x20 ml)洗滌，經硫酸鈉脫水及真空濃縮。殘質經管柱層析法純化(SiO₂，乙酸乙酯:環己烷1:9)，產生1.06 g所需產物(20%)，經質譜與NMR光譜鑑別特性。

步驟 2：(Z)-3-(4-氯-苯基)-3-氟-丙-2-烯-1-醇之製法

步驟 3：1-氯-4-((Z)-3-氯-1-氟-丙烯基)-苯之製法

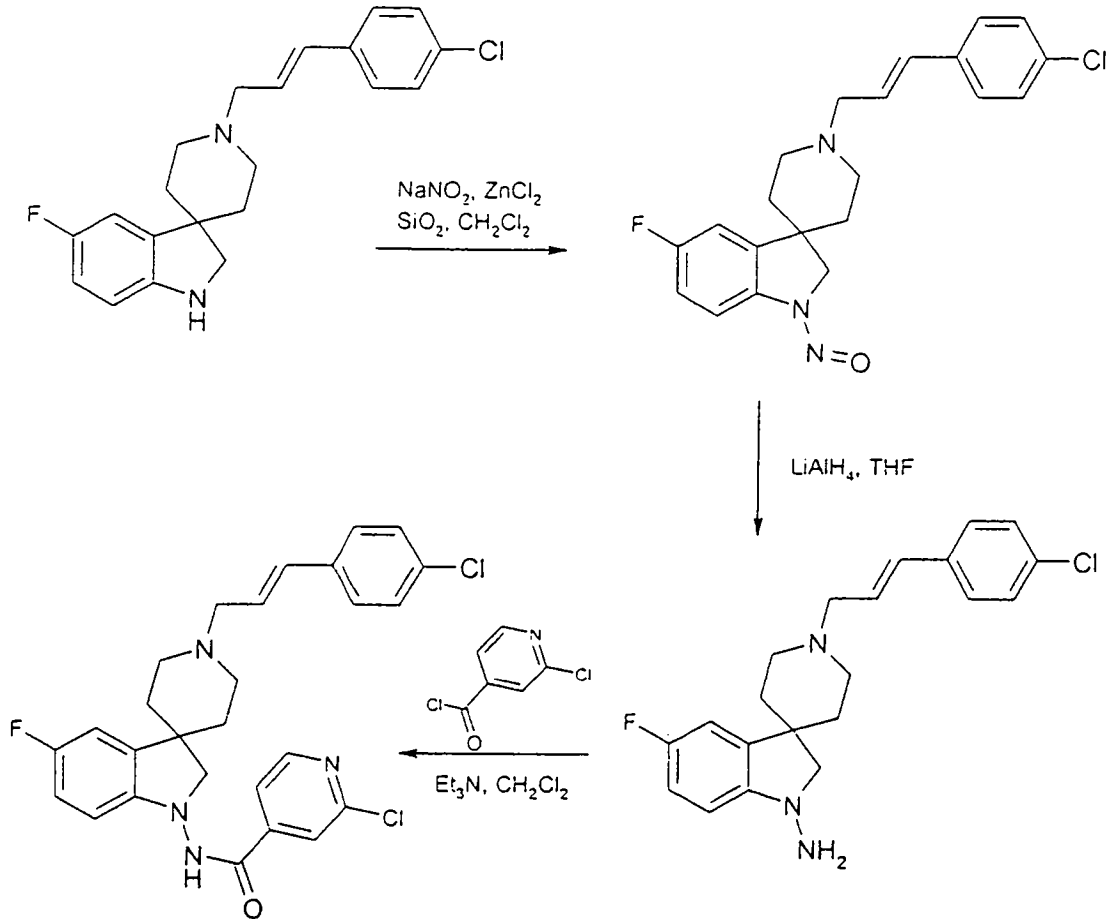
步驟 4：1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氯-1'-[(Z)-3-(4-氯-苯基)-3-氟-烯丙基]螺[吡啶-3,4'-六-氮吡啶]之製法

步驟 2 至 4 係依實例 11 步驟 2-4 之方法製備，產生 163 mg 所需產物(42%)，經質譜與NMR光譜鑑別特性。MS (ES⁺) 531。

類似上述實例 12 所述標準方法，製備化合物 XXX-88 與 XXX-90。

實例 13

此實例說明化合物XXX-121與XXX-94：1-羧酸(4-氯-苯基)-醯胺-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]之製法。



類似實例4步驟1至4之方法製備5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]。

步驟1：化合物XXX-121：1-亞硝基-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]之製法

添加含5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶](5 g)之二氯甲烷(15 ml)溶液至含濕矽膠(50% w/w於水中，2.9 g)與氯化鋅(5.73 g)之二氯甲烷(15 ml)溶液，所得混合物於室溫下攪拌3.5小時。反應混合物經乙酸乙酯稀釋，過濾排除不溶性殘質。濾液經飽和碳酸氫鈉水溶

液、水與鹽水洗滌，經硫酸鈉脫水，真空蒸發溶劑，產生 5.13 g (95%) 所需亞硝基-胺之固體。MS (ES+) 386。

步驟 2：1-胺基-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]之製法

於 0°C 下，滴加含 1-亞硝基-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶] (5 g) 之四氫呋喃 (60 ml) 溶液至含氫化鋰鋁 (1.47 g) 之四氫呋喃 (60 ml) 懸浮液中，所得混合物於室溫下攪拌 2.5 小時。小心加水 (4.8 ml) 後，添加 15% 氫氧化鈉水溶液 (4.8 ml)，最後加水 (14.4 ml)。混合物攪拌 0.5 小時，以乙酸乙酯稀釋，以硫酸鈉脫水，過濾。真空蒸發溶劑，產生 5.1 g (100%) 所需胺基-吡啶啉之固體。MS (ES+) 372。

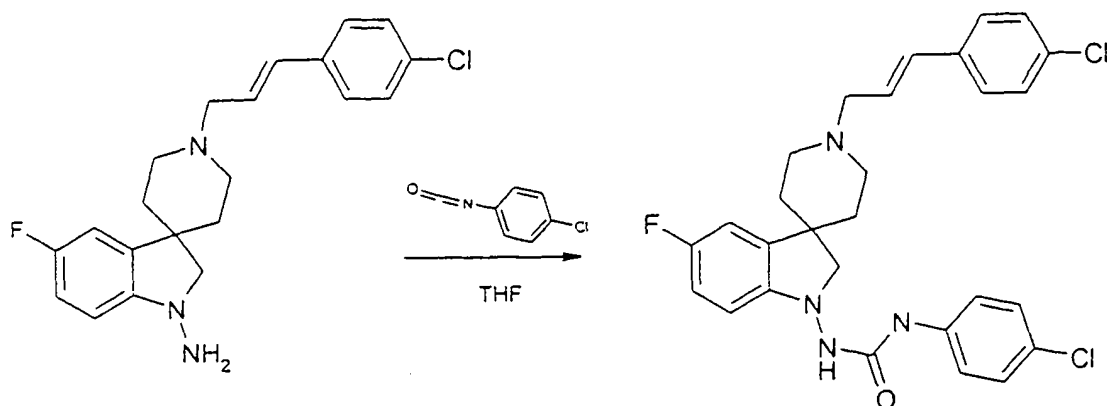
步驟 3：1-羧酸(4-氯-苯基)-醯胺-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]之製法

於室溫下，添加 2-氯異菸醯基氯 (1.2 g) 至含 1-胺基-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶] (0.2 g) 與三乙胺 (0.3 ml) 之二氯甲烷 (4 ml) 攪拌溶液中。混合物攪拌 2 小時。反應混合物經水洗滌，水層經二氯甲烷萃取。合併之有機層脫水 (硫酸鈉)，過濾及蒸發。粗產物經層析法純化 [SiO₂; 乙酸乙酯-甲醇 (96:4)]，產生 0.13 g (48%) 所需產物。MS (ES+) 511。

類似上述實例 13 所述標準方法，製備化合物 XXX-95，XXX-97，XXX-98 與 XXX-99。

實例 14

此實例說明化合物 XXX-119：1-(4-氯-苯基)-脛-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]之製法。

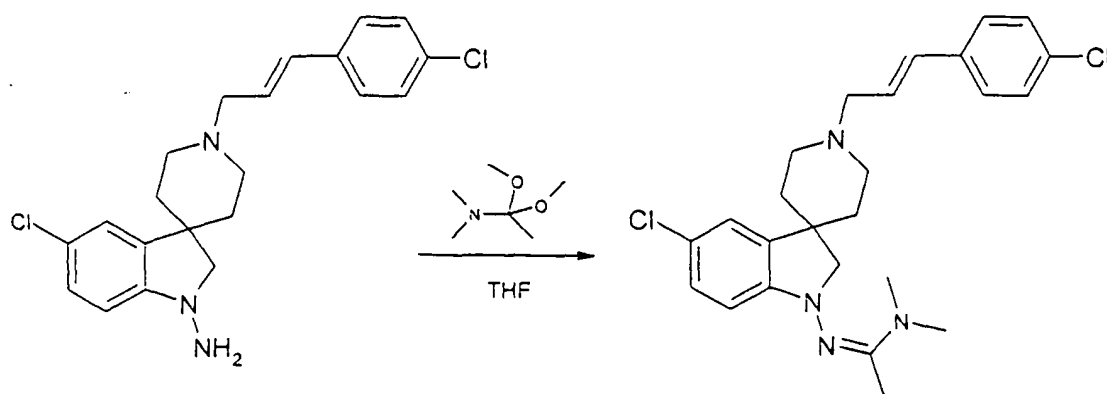


在含1-胺基-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶](0.2 g)之四氫呋喃(2 ml)溶液中添加4-氯苯基異氰酸酯(70 mg)，混合物於室溫下攪拌10分鐘。真空蒸發溶劑，殘質經製備性HPLC純化，產生標題化合物(49%)之固體。MS (ES+) 525。

類似上述實例14所述標準方法，製備化合物XXX-100，XXX-101，XXX-102與XXX-103。

實例 15

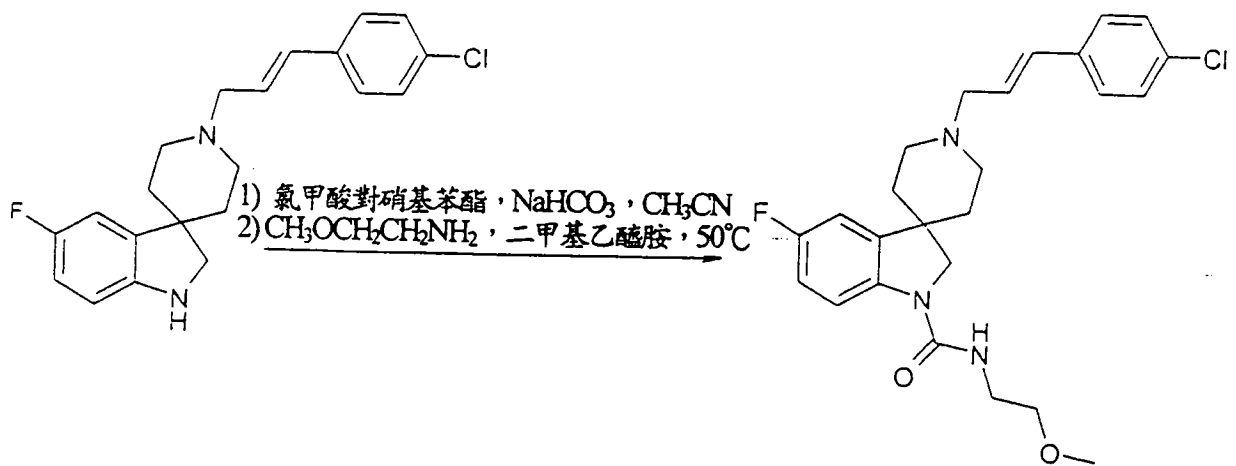
此實例說明化合物 XXX-102：N'-[5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]-1-基]-N,N-二甲基乙脛之製法



在含1-胺基-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶](0.15 g)之四氫呋喃(2 ml)溶液中添加N,N-二甲基乙醯胺二甲基縮醛(0.2 g)，混合物於70°C下攪拌24小時。真空蒸發溶劑，殘質經層析法純化[SiO₂；乙酸乙酯-甲醇(9:1)]，產生35 mg(20%)所需產物。MS (ES+) 457。

實例 16

此實例說明化合物 XXX-105：1-[羧酸(2-甲氧基-乙基)-醯胺]-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶]之製法



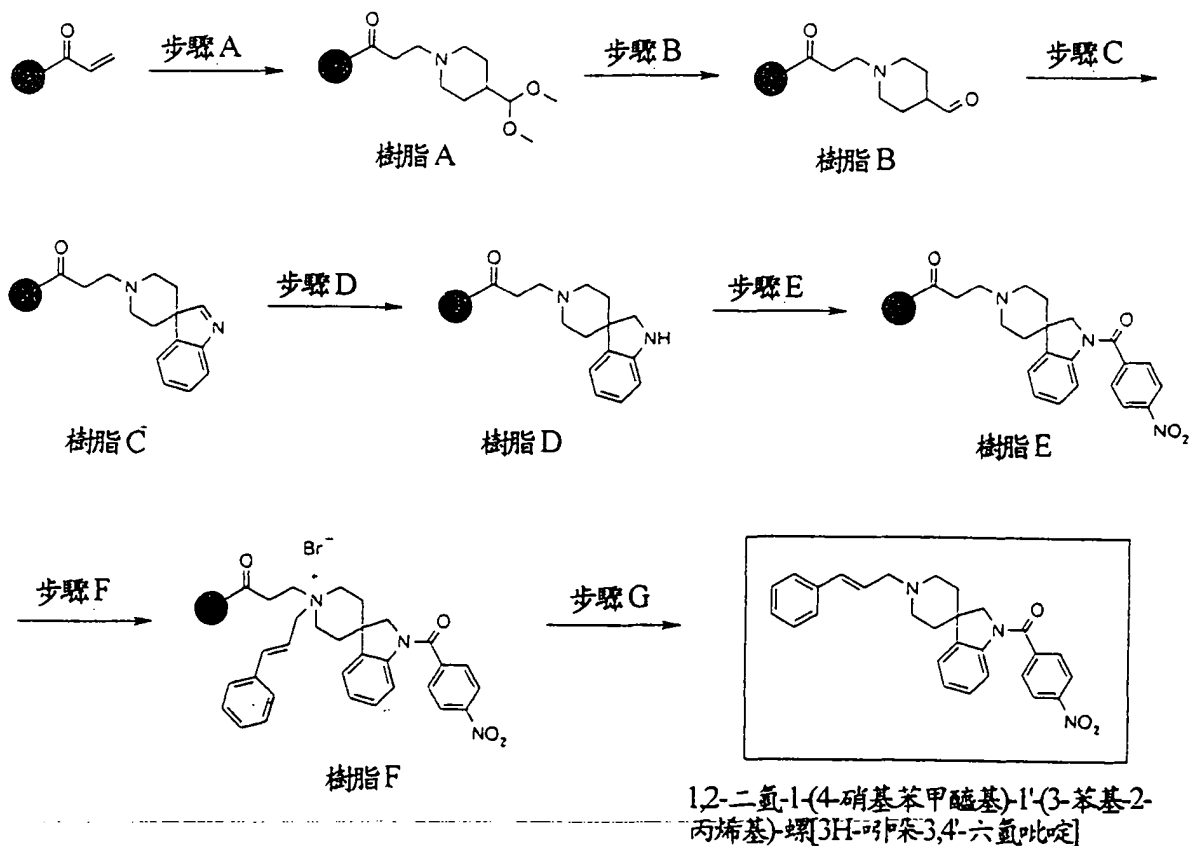
添加5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[吡啶啉-3,4'-六氫吡啶](2.5 g)至含碳酸氫鈉(1.7 g)之乙腈(45 ml)懸浮液中，所得混合物冷卻至0°C。滴加氯甲酸4-硝基苯酯(2.54 g)，所得溶液於0°C下攪拌2小時。添加3 ml溶液至含2-甲氧基-乙胺(315 mg)與三乙胺(0.3 ml)之二甲基甲醯胺(10 ml)溶液中，所得混合物於50°C下攪拌3小時。溶液冷卻至室溫，倒至水中，以乙酸乙酯萃取3次。有機相經硫酸鈉脫水，過濾，真空排除溶劑。殘質經逆向HPLC純化，產生所需產物

(收率 57%)。MS (ES+)458。

類似上述實例 16 所述標準方法，製備化合物 XXX-104，XXX-106，XXX-107，XXX-108，XXX-109，XXX-110，XXX-111 與 XXX-112。

實例 17

化合物 XXVI-1：1,2-二氫-1-(4-硝基苯甲醯基)-1'-(3-苯基-2-丙烯基)-螺[3H-吡咯-3,4'-六氫吡啶]之製法



下列實驗細節中，標準洗滌法係指下列洗滌順序：二甲基甲醯胺、二氯甲烷、二甲基甲醯胺、二氯甲烷、甲醇、二氯甲烷、甲醇(X2)、第三丁基甲醚(X2)，且樹脂膨脹法將以每克樹脂 10 ml 溶劑之標準進行。化合物鑑定法與純度

係採用高效液相層析法偶合質譜儀(HPLC-MS)及質核磁共振(^1H NMR)測定幾種選定之化合物。REM樹脂係由市售(羥甲基)聚苯乙烯樹脂與丙烯醯基氯製備。合成過程中之樹脂之承載量假定為恆定之1.2毫莫耳/克。

步驟A: 4-甲醯基六氫吡啶二甲基縮醛於REM樹脂上之承載法(樹脂A)

取REM樹脂(10 g, 12 mmol)於二甲基甲醯胺(100 ml)中膨脹。添加含4-甲醯基六氫吡啶二甲基縮醛(2.86 g, 18 mmol)之二甲基甲醯胺(10 ml)溶液。反應於室溫下振盪18小時。所得樹脂過濾，依標準製程洗滌，真空乾燥，產生11.83 g (收率96%)所需樹脂A。

步驟B: 固體承載之4-甲醯基六氫吡啶(樹脂B)之製法

添加100 ml三氟乙酸/二氯甲烷/水(49:49:2)溶液至樹脂A(10 g, 12 mmol)中，混合物於室溫下振盪2小時。所得樹脂過濾，以二氯甲烷(x3)、甲醇、二氯甲烷、甲醇、第三丁基甲基醚(x2)洗滌，真空乾燥，產生9.48 g所需樹脂B，保存在氮蒙氣與 -50°C 下。

步驟C: 固體承載之螺[3H-吡啶-3,4'-六氫吡啶](樹脂C)之製法

在樹脂B(1g, 1.2mmol)中添加5%三氟乙酸之二氯甲烷(10 ml)溶液後，添加苯甲醚(0.0026 g, 0.024 mmol)。混合物經氮氣脫氣10分鐘，添加苯基胍(0.39 g, 3.6 mmol)。反應混合物於氮蒙氣下攪拌，加熱至回流36小時。混合物過濾，依據標準洗滌循環洗滌，真空乾燥，產生1.09 g所需樹脂C，

立即用於步驟D中。

步驟D：固體承載之1,2-二氫-螺[3H-吡啶-3,4'-六氫吡啶](樹脂D)之製法

在於無水二氯甲烷(10 ml)中膨脹之樹脂C(1g, 1.2 mmol)中添加三乙醯氧基氫硼化鈉(0.51 g, 2.4 mmol)固體。反應混合物於室溫與氮氣下攪拌2小時。過濾樹脂，依據標準洗滌循環洗滌，真空乾燥，產生0.95 g所需樹脂D，存放於氮氣與-50°C下。

步驟E：固體承載之1,2-二氫-1-(4-硝基苯甲醯基)-螺[3H-吡啶-3,4'-六氫吡啶](樹脂E)之製法

在於無水二氯甲烷(5 ml)中膨脹之樹脂D(0.5g, 0.6mmol)中添加4-硝基苯甲醯基氫(0.33 g, 1.8 mmol)與N,N-二異丙基乙胺(0.42ml, 2.4 mmol)。於室溫下振盪18小時後，過濾樹脂，依據標準洗滌循環洗滌，真空乾燥，產生0.53 g所需樹脂E。

步驟F：固體承載之1,2-二氫-1-(4-硝基苯甲醯基)-螺[3H-吡啶-3,4'-六氫吡啶](樹脂F)之四級化法

在含樹脂E(0.1g, 0.12 mmol)之無水二甲基甲醯胺(1 ml)中添加肉桂基溴(0.12g, 0.6 mmol)。反應混合物於室溫下振盪48小時。所得樹脂依據標準洗滌循環洗滌，產生0.11 g所需樹脂F，立即用於步驟G。

步驟G：1,2-二氫-1-(4-硝基苯甲醯基)-1'-(3-苯基-2-丙烯基)-螺[3H-吡啶-3,4'-六氫吡啶]之製法

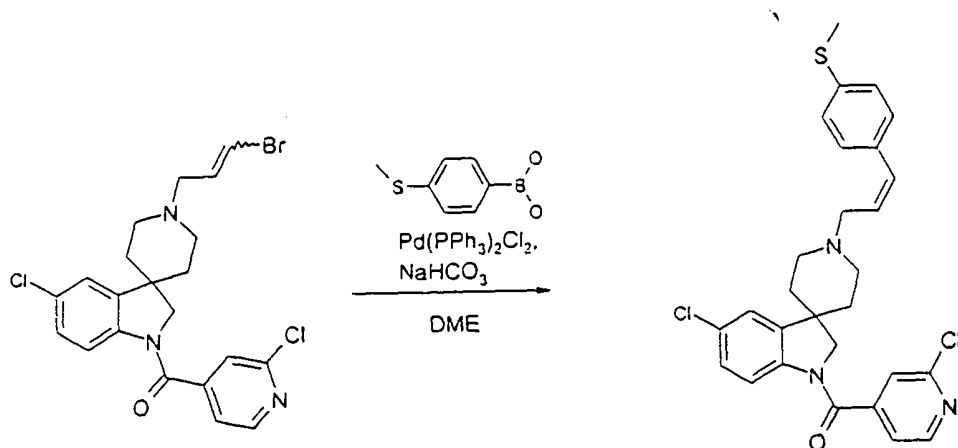
在含樹脂F(0.11 g, 0.132 mmol)之無水二甲基甲醯胺(1.1

ml)中添加 Amberlite IRA-93 (先經10% N,N-二異丙基乙胺/二甲基甲醯胺洗滌)(0.11 g)。混合物於室溫下振盪36小時。收集二甲基甲醯胺濾液，減壓濃縮。樹脂再經二氯甲烷與甲醇洗滌。然後合併所有濾液，真空濃縮，產生0.052 g(收率88%)所需化合物之淺黃色油狀物。

依類似方法可製備之其他化合物包括化合物 XVI-21：5-氯-1,2-二氫-1-(4-硝基苯甲醯基)-1'-(3-苯基-2-丙烯基)-螺[3H-吡啶-3,4'-六氫吡啶]。

實例 18

此實例說明化合物 XXX-72：1-(2-氯吡啶-4-基)羧基-5-氯-1'-[(Z)-3-(4-甲硫苯基)烯丙基]螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]之製法



在含 13.1 mg 4-硫甲基二羥硼酸之 "Zisser-block" 中添加含 14.5 mg 1-(2-氯吡啶-4-基)羧基-5-氯-1'-[(E/Z)-3-溴-烯丙基]螺[吡啶-3,4'-六氫吡啶]之 0.05 ml 二甲氧乙烷、含 8 mg 碳酸氫鈉之 0.3 ml H₂O 與 2 mg 雙-(三苯基膦)鈀(II)二氯化物。混合物於 75°C 下攪拌 13 小時。分離有機層，真空蒸發，殘

法純化(H₂O-乙腈梯度)，產生所需產物，MS (ES+)

以方法製備之其他化合物包括 XXX1-4, XXX-51, XXX-52, XXX-53, XXX-54, XXX-55, XXX-56, XXX-57, XXX-58, XXX-59, XXX-60, XXX-61, XXX-62, XXX-63, XXX-64, XXX-65, XXX-66, XXX-67, XXX-68, XXX-69, XXX-70, XXX-71, XXX-73, XXX-74, XXX-75, XXX-76, XXX-77, XXX-78, XXX-79, XXX-80, XXX-81, XXXI-3, XXXI-5, XXXI-6與 XXXI-7。

實例 19

此實例說明式(I)化合物之殺有害生物/殺昆蟲性質。

依下列方法進行對抗試驗：

Spodoptera littoralis (斜紋夜蛾)

取棉花葉圓片置於24孔微滴定板之洋菜上，依200 ppm之施用率噴灑試驗溶液。乾燥後，以5隻L₁幼蟲感染葉圓片。處理3天後(DAT)，檢查樣本之死亡率、驅蟲效果、攝食行為與生長調節性。下列化合物對斜紋夜蛾之防治率為至少80%：

I-2, I-12, I-21, I-22, I-23, I-32, I-52, I-61, I-62, I-72, I-82, I-92, I-112, I-132, I-142, I-152, I-162, I-182, I-192, I-202, I-212, I-222, I-232, I-242, I-252, I-262, I-282, II-62, V-22, VI-22, VI-62, VI-202, X-22, X-62, XI-62, XII-22, XIII-62, XIV-22, XV-22, XVII-62, XVIII-22, XIX-22, XIX-202, XX-22, XX-62, XXI-22, XXI-62, XXII-22, XXVI-2,

XXVI-22, XXVII-2, XXVII-22, XXIX-43, XXIX-93,
 XXIX-195, XXIX-196, XXIX-201, XXX-10, XXX-106,
 XXX-107, XXX-118, XXX-15, XXX-16, XXX-18, XXX-24,
 XXX-26, XXX-28, XXX-3, XXX-36, XXX-43, XXX-48,
 XXX-49, XXX-52, XXX-55, XXX-57, XXX-60, XXX-67,
 XXX-83, XXX-84, XXX-87, XXX-88, XXX-99, XXXI-8,
 XXXII-4, XXX-104, XXX-105, XXX-109, XXX-112,
 XXX-113, XXX-114, XXX-117, XXX-12, XXX-13, XXXI-4,
 XXX-19, XXX-2, XXX-20, XXX-30, XXX-38, XXX-39,
 XXX-40, XXX-41, XXX-42, XXX-44, XXX-45, XXX-50,
 XXX-53, XXX-59, XXX-6, XXX-61, XXX-62, XXX-65,
 XXX-7, XXX-70, XX-8, XXX-82, XXX-89, XXX-95, XXXI-2,
 XXXI-7, XXX-11, XXXI-1, XXX-110, XXX-111, XXX-31,
 XXX-51, XXX-66, XXX-86, XXX-93與XXXI-5。

Heliothis virescens(菸夜蛾)：

取蟲卵(0-24小時大)置於24孔微滴定板之人工飼料上，使用定量吸管，依200 ppm之施用率施用試驗溶液處理。培養4天後，檢查蟲卵死亡率、幼蟲死亡率與生長調節性。下列化合物對菸夜蛾之防治率為至少80%：

I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-12, I-21, I-22, I-23, I-32, I-52, I-61,
 I-62, I-72, I-82, I-92, I-112, I-132, I-142, I-152, I-162, I-171,
 I-182, I-192, I-202, I-212, I-222, I-232, I-242, I-252, I-262,
 I-282, I-292, II-301, II-22, II-62, V-21, V-22, V-62, V-192,
 V-202, VI-I, VI-22, VI-62, VI-101, VI-202, IX-62, X-22,

X-62, XI-62, XII-22, XIII-22, XIII-62, XIV-22, XV-22,
 XVII-62, XVIII-22, XVIII-202, XIX-22, XIX-202, XX-22,
 XX-62, XXI-22, XXI-62, XXII-22, XXV-222, XXVI-2,
 XXVI-22, XXVII-2, XXVII-22, XXVIII-7, XXVIII-27,
 XXVIII-42, XXVIII-67, XXVIII-97, XXVIII-132,
 XXVIII-187, XXVIII-217, XXVIII-252, XXIX-1, XXIX-7,
 XXIX-13, XXIX-57, XXIX-63, XXIX-75, XXIX-81, XXIX-87,
 XXIX-93, XXIX-111, XXIX-117, XXIX-123, XXIX-129,
 XXIX-141, XXIX-147, XXIX-153, XXIX-159, XXIX-165,
 XXIX-171, XXIX-183, XXIX-195, XXIX-196, XXIX-201,
 XXX-100, XXX-107, XXX-108, XXX-109, XXX-116,
 XXX-14, XXX-15, XXX-17, XXX-23, XXX-32, XXX-35,
 XXX-4, XXX-43, XXX-46, XXX-55, XXX-56, XXX-63,
 XXX-64, XXX-7, XXX-71, XXX-72, XXX-73, XXX-76,
 XXX-77, XXX-78, XXX-79, XXX-80, XXX-81, XXX-85,
 XXX-88, XXX-92, XXX-94, XXX-98, XXXII-1, XXXII-2,
 XXXII-3, XXXII-5, XXXII-8, XXXII-9, XXX-1, XXX-10,
 XXX-105, XXX-106, XXX-112, XXX-115, XXX-118,
 XXX-12, XXX-16, XXX-18, XXX-19, XXX-21, XXX-22,
 XXX-24, XXX-26, XXX-28, XXX-29, XXX-33, XXX-34,
 XXX-37, XXX-50, XXX-54, XXX-58, XXX-60, XXX-65,
 XXX-67, XXX-68, XXX-74, XXX-75, XXX-83, XXX-87,
 XXX-9, XXX-91, XXX-93, XXX-96, XXX-99, XXXI-3,
 XXXI-6, XXXII-10, XXXII-4, XXXII-6, XXXI-1, XXX-110,

XXX-111, XXX-113, XXX-114, XXX-117, XXX-13, XXX1-4,
 XXX-2, XXX-20, XXX-3, XXX-30, XXX-31, XXX-36,
 XXX-38, XXX-40, XXX-41, XXX-44, XXX-45, XXX-48,
 XXX-49, XXX-5, XXX-53, XXX-57, XXX-59, XXX-6,
 XXX-61, XXX-62, XXX-7, XXX-8, XXX-82, XXX-89,
 XXX90, XXXI-2, XXX-120與XXXI-7。

Plutella xylostella(小菜蛾)

使用定量吸管，依18.2 ppm之施用率施用試驗溶液處理24孔微滴定板(MTP)。乾燥後，以L2幼蟲感染MTP(每孔10-15隻)。培養5天後，檢查樣本之幼蟲死亡率、抗攝食性與生長調節性。下列化合物對小菜蛾之防治率為至少80%：

I-1, I-2, I-3, I-4, I-5, I-12, I-21, I-22, I-23, I-32, I-52, I-61,
 I-62, I-72, I-82, I-92, I-112, I-132, I-142, I-152, I-162, I-171,
 I-192, I-202, I-212, I-222, I-242, I-252, I-262, I-282, I-292,
 II-22, II-62, V-22, V-62, V-202, VI-22, VI-62, IX-62, X-22,
 X-62, XI-62, XII-22, XIII-62, XIV-22, XV-22, XVII-62,
 XX-22, XXI-62, XXII-22, XXV-62, XXVI-2, XXVI-22,
 XXVII-1, XXVII-2, XXVII-22, XXVIII-97, XXVIII-187,
 XXIX-129, XXIX-135, XXIX-159, XXIX-177, XXIX-189,
 XXIX-195, XXIX-196, XXX-10, XXX-100, XXX-109,
 XXX-112, XXX-117, XXX-16, XXX-18, XXX-19, XXX-21,
 XXX-28, XXX-34, XXX-36, XXX-43, XXX-48, XXX-5,
 XXX-50, XXX-54, XXX-59, XXX-60, XXX-66, XXX-68,
 XXX-69, XXX-75, XXX-83, XXX-90, XXX-91, XXX-98,

XXXI-2, XXXI-7, XXXII-4, XXXII-8, XXXII-9, XXX-101, XXX-104, XXX-107, XXX-110, XXX-111, XXX-118, XXX-12, XXX-13, XXXI-4, XXX-22, XXX-3, XXX-30, XXX-37, XXX-39, XXX-40, XXX-41, XXX-42, XXX-44, XXX-49, XXX-57, XXX-61, XXX-7, XXX-89, XXX-105, XXX-106, XXXI-1, XXX-113, XXX-114, XXX-31, XXX-35, XXX-38, XXX-45, XXX-46, XXX-47, XXX-53, XXX-62, XXX-67, XXX-70, XXX-8, XXX-86, XXXI-5, XXX-2, XXX-120與XXX-51。

Myzus persicae (蚜蟲)

取向日葵葉圓片置於24孔微滴定板之洋菜上，依200 ppm之施用率噴灑試驗溶液。乾燥後，以混齡之蚜蟲族群感染葉圓片。處理6天後，檢查樣本死亡率。下列化合物對蚜蟲之防治率為至少80%：

I-2, I-21, II-62, XI-62, XXVII-2, XXVIII-162, XXIX-49, XXX-111, XXX-13, XXX-29, XXX-34與XXX-47。

Tetranychus urticae(棉紅蜘蛛)：

取豆類葉圓片置於24孔微滴定板之洋菜上，依200 ppm之施用率噴灑試驗溶液。乾燥後，以混齡之蜘蛛族群感染葉圓片。處理8天後，檢查葉圓片上蟲卵死亡率、幼蟲死亡率、與成蟲死亡率。下列化合物對棉紅蜘蛛之防治率為至少80%：

I-202, XIII-22, XIX-202, XXVI-1, XXVIII-162, XXIX-207, XXX-57與XXXI-2。

Aedes aegypti(埃及伊蚊)

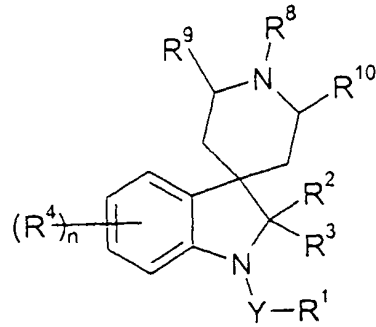
取10-15隻埃及伊蚊幼蟲(L2)與營養混合物共同置於96孔微滴定板中。依2 ppm之施用率吸取試驗溶液加至孔中。2天後，檢查死亡率與生長抑制性。下列化合物對埃及伊蚊之防治率為至少80%：

I-4, I-5, I-12, I-21, I-22, I-23, I-32, I-52, I-61, I-62, I-72, I-82, I-92, I-112, I-132, I-142, I-152, I-162, I-202, I-212, I-222, I-232, I-242, I-252, I-262, I-292, II-22, II-62, V-22, VI-22, VI-62, VI-202, XIV-22, XV-22, XVII-62, XVIII-22, XIX-22, XX-22, XXI-22, XXI-62, XXII-22, XXVI-2, XXVI-22, XXVII-22, XXVIII-7, XXVIII-27, XXVIII-67, XXVIII-97, XXVIII-187, XXIX-13, XXIX-19, XXIX-25, XXIX-31, XXIX-37, XXIX-69, XXIX-75, XXIX-93, XXIX-99, XXIX-105, XXIX-117, XXIX-123, XXIX-129, XXIX-135, XXIX-159, XXIX-183, XXX-102, XXX-105, XXX-11, XXX-110, XXX-117, XXX-24, XXX-28, XXX-31, XXX-34, XXX-4, XXX-48, XXX-49, XXX-52, XXX-57, XXX-59, XXX-60, XXX-61, XXX-67, XXX-68, XXX-7, XXX-70, XXX-75, XXX-78, XXX-79, XXX-82, XXX-83, XXX-84, XXX-87, XXX-88, XXX-90, XXX-93, XXX-94, XXX-97, XXXI-2, XXXI-7, XXXI-8, XXXII-10, XXXII-4, XXX-104, XXX-106, XXXI-1, XXX-111, XXX-113, XXX-114, XXX-118, XXX-12, XXX-13, XXX-14, XXX-16, XXX-17, XXX-18, XXX-19, XXX-2, XXX-20, XXX-22, XXX-26, XXX-3,

XXX-30, XXX-35, XXX-38, XXX-39, XXX-44, XXX-46,
XXX-47, XXX-5, XXX-50, XXX-53, XXX-62, XXX-86,
XXX-98, XXXI-5, XX-109, XXX-45, XXX-51, XXX-6,
XXX-66, XXX-121與 XXX-8。

伍、中文發明摘要：

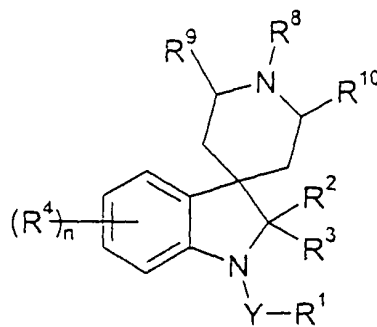
本發明係有關一種如式(I)之殺昆蟲、殺蟬蟎、殺線蟲或殺軟體動物之化合物



其中Y為單鍵、C=O、C=S或S(O)_q其中q為0、1或2；且R¹、R²、R³、R⁴、R⁸、R⁹與R¹⁰如申請專利範圍中之定義，或其鹽或N-氧化物，及其製法與含其之組合物。

陸、英文發明摘要：

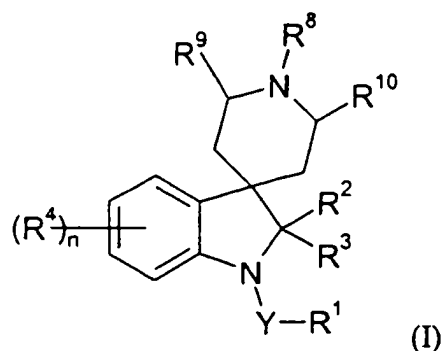
Insecticidal, acaricidal, nematocidal or molluscicidal compounds of formula (I)



wherein Y is a single bond, C=O, C=S or S(O)_q where q is 0, 1 or 2; and R¹, R², R³, R⁴, R⁸, R⁹ are R¹⁰ are as defined in the claims or salts or N-oxides thereof, processes for preparing them and compositions containing them.

拾、申請專利範圍：

1. 一種防治昆蟲、蟬蟎、線蟲或軟體動物之方法，其包括對該有害生物、有害生物之所在地或容易受有害生物侵害之植物施用殺昆蟲、殺蟬蟎、殺線蟲或殺軟體動物有效量之式(I)化合物或其鹽或N-氧化物：



其中 Y 為單鍵、C=O 或 S(O)₂；R¹ 為 C₁₋₆ 烷基、C₁₋₆ 鹵烷基、C₁₋₆ 烷氧基 (C₁₋₆) 烷基、雜芳基 (C₁₋₃) 烷基 (其中雜芳基可視需要經鹵素、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 烷氧羰基取代，或雜芳基系上兩個相鄰位置可環化形成 5、6 或 7 員碳環系或雜環系環 (其本身可視需要經鹵素取代))、苯基 (C₁₋₃) 烷基 (其中苯基可視需要經鹵素、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，或苯基環上兩個相鄰位置可環化形成 5、6 或 7 員碳環系或雜環系環 (其本身可視需要經鹵素取代))、苯基 (其可視需要經鹵素、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、 C_{1-6} 烷磺醯基、 C_{1-6} 烷氧羰基取代，或苯基環上兩個相鄰位置可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環(其本身可視需要經鹵素取代))、雜芳基(其可視需要經鹵素、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，或雜芳基系上兩個相鄰位置可環化形成5、6或7員碳環系或雜環系環(其本身可視需要經鹵素取代))、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{2-6} 烯基、雜環基(可視需要經鹵素、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 $NR^{13}R^{14}$ ，其中 R^{13} 與 R^{14} 分別獨立為氫、 C_{2-6} 烷基或 C_{2-6} 鹵烷基、 C_{2-6} 烷羰基或苯羰基(其中苯基可視需要經鹵素、 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)；

R^2 與 R^3 分別獨立為氫或 C_{1-4} 烷基；

各 R^4 分別獨立為鹵素、氰基、 C_{1-8} 烷基、 C_{1-8} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基、 C_{2-6} 炔基、三甲矽烷基(C_{2-6})炔基、 C_{1-6} 烷氧羰基、 C_{3-7} 環烷基、苯基(可視需要經鹵素、 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_{1-8} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、苯氧基(可視需要經鹵素、 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)、二(C_{1-8})烷胺基，或2個相鄰基團 R^4 與其相鄰碳原子共同形成4、5、6或7員碳環系或雜環系環，其可視需要經鹵素取代；n為0、1、2、3

或 4；

R^8 為苯基(C_{1-4})烷基(其中苯基可視需要經鹵素、 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(其中雜芳基可視需要經鹵素、 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)、苯基(C_{2-6})-烯基(其中苯基可視需要經鹵素、 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)，或苯基(C_{2-6})炔基(其中苯基可視需要經鹵素、 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)，或 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ ，其中 z 為 1 或 2， R^{51} 與 R^{52} 分別獨立為 H、鹵素或 C_{1-2} 烷基， R^{53} 與 R^{54} 分別獨立為 H、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基，且 R^{55} 為芳基(其視需要經一或多個獨立選自鹵素、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、硝基、氰基、胺基、二烷胺基、芳基或雜芳基之取代基取代)或雜芳基(其視需要經一或多個獨立選自鹵素、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、硝基、氰基、胺基、二烷胺基、芳基或雜芳基之取代基取代)；

R^9 與 R^{10} 均為氫，且其中

「芳基」為苯環，

「雜芳基」為 5-或 6-員環原子所組成之芳香環系，其包

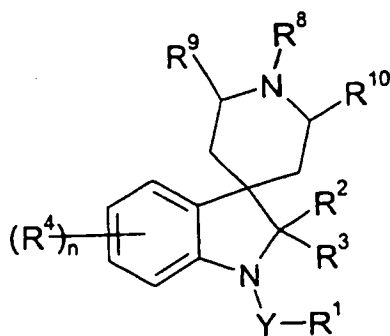
含一或二個選自氮、氧或硫之雜原子，且

「雜環基」或「雜環系環」為5-或6-員環原子所組成之非芳香環系，其包含一或二個選自氮、氧或硫之雜原子。

2. 根據申請專利範圍第1項之方法，其中Y為鍵結或為C=O。
3. 根據申請專利範圍第1或2項之方法，其中R¹為C₁₋₆烷基、C₁₋₆鹵烷基、雜芳基(C₁₋₃)烷基(其中雜芳基可視需要經鹵素、氟基、C₁₋₆烷基、C₁₋₆鹵烷基取代)(其中雜芳基為吡啶、嘧啶、吡嘞或嗒嘞環)、雜芳基(可視需要經鹵素、氟基、C₁₋₆烷基、C₁₋₆鹵烷基取代)(其中雜芳基為吡啶、嘧啶、吡嘞或嗒嘞環)、C₁₋₆烷氧基或雜環基(可視需要經鹵素、氟基、C₁₋₃烷基、C₁₋₃鹵烷基或C₁₋₃烷氧基取代)。
4. 根據申請專利範圍第1或2項之方法，其中R²與R³分別獨立為氫或C₁₋₄烷基。
5. 根據申請專利範圍第1或2項之方法，其中各R⁴分別獨立為鹵素、氟基、C₁₋₈烷基、C₁₋₈鹵烷基、C₁₋₆烷氧基(C₁₋₆)烷基、C₂₋₆炔基、C₁₋₈烷氧基、C₁₋₆鹵烷氧基、苯氧基(可視需要經鹵素、氟基、C₁₋₃烷基或C₁₋₃鹵烷基取代)、二(C₁₋₈)烷胺基，或2個相鄰基團R⁴與其相鄰碳原子共同形成4、5、6或7員碳環系或雜環系環，其可視需要經鹵素取代；n為0、1、2、3或4。
6. 根據申請專利範圍第1或2項之方法，其中R⁸為苯基CH₂- (其中苯基可視需要經鹵素、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 CH_2 - (其中雜芳基為可視需要經鹵素、 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雙環基), 或 $-\text{C}(\text{R}^{51})(\text{R}^{52})-[\text{CR}^{53}=\text{CR}^{54}]_z-\text{R}^{55}$, 其中 z 為 1 或 2, R^{51} 與 R^{52} 分別獨立為 H 、鹵素或 C_{1-2} 烷基, R^{53} 與 R^{54} 分別獨立為 H 、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基, 且 R^{55} 為芳基 (其視需要經一或多個獨立選自鹵素、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、硝基、氰基、胺基、二烷胺基、芳基或雜芳基之取代基取代) 或雜芳基 (其視需要經一或多個獨立選自鹵素、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、硝基、氰基、胺基、二烷胺基、芳基或雜芳基之取代基取代)。

7. 一種式 (IK) 化合物及其鹽或 N -氧化物



其中, Y 為單鍵、 $\text{C}=\text{O}$ 或 $\text{S}(\text{O})_q$, 其中 q 為 0、1 或 2; R^1 為 C_{1-8} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-6} 氰基烷基、 C_{3-7} 環烷基 (C_{1-6}) 烷基、 C_{1-6} 烷氧基 (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} 烷亞磺醯基(C_{1-6})烷基、 C_{1-6} 烷磺醯基(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(其中苯基可視需要經鹵素、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)、雜芳基(C_{1-4})烷基(其中雜芳基可經鹵素、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(其中雜環基可經鹵素、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)、苯基(可視需要經鹵素、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)、雜芳基(可視需要經鹵素、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} 烷氧基、 C_{1-6} 鹵烷氧基、 C_{2-6} 烯基、 C_{2-6} 鹵烯基、 C_{2-6} 炔基、 C_{3-7} 環烷基、甲醯基、雜環基(可視需要經鹵素、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 C_{1-6} 烷硫基； R^2 與 R^3 分別獨立為氫或 C_{1-4} 烷基；各 R^4 分別獨立為鹵素、氰基、 C_{1-10} 烷基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代))、 C_{2-6} 烯基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代))或 C_{2-6} 炔基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經

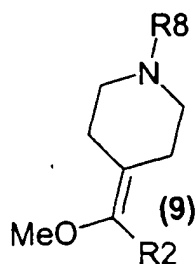
鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代))； n 為0、1、2、3或4； R^8 為 C_{1-10} 烷基，其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素、苯基(其本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代)、 C_{2-6} 烯基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代))或 C_{2-6} 炔基(其可視需要經下列基團取代： C_{1-6} 烷氧基、鹵素或苯基(其本身可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代))； R^9 與 R^{10} 均為氫；但其限制條件為 R^8 不為甲基且 YR^1 不為 SO_2CH_3 、甲基、乙基、苯基或經氟取代之苯基，且其中

「芳基」為苯環，

「雜芳基」為5-或6-員環原子所組成之芳香環系，其包含一或二個選自氮、氧或硫之雜原子，且

「雜環基」或「雜環系環」為5-或6-員環原子所組成之非芳香環系，其包含一或二個選自氮、氧或硫之雜原子。

8. 一種式(9)化合物



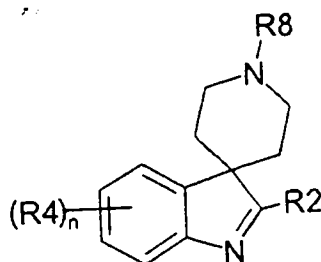
其中 R^2 如申請專利範圍第1項中式(I)之定義， R^8 為苯基(C_{2-4})烯基(其中苯基可視需要經鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、雜芳基、胺基或二烷胺基取代)，且其中

「芳基」為苯環；

「雜芳基」為5-或6-員環原子所組成之芳香環系，其包含一或二個選自氮、氧或硫之雜原子，且

「雜環基」或「雜環系環」為5-或6-員環原子所組成之非芳香環系，其包含一或二個選自氮、氧或硫之雜原子。

9. 一種式(9A)化合物



(9A)

其中 R^2 與其中 $(R^4)_n$ 如申請專利範圍第1項中式(I)之定義， R^8 為苯基(C_{2-4})烯基(其中苯基可視需要經鹵素、 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)，且其中

「芳基」為苯環，

「雜芳基」為5-或6-員環原子所組成之芳香環系，其包含一或二個選自氮、氧或硫之雜原子，且

「雜環基」或「雜環系環」為5-或6-員環原子所組成之非芳香環系，其包含一或二個選自氮、氧或硫之雜原子。

10. 一種殺昆蟲、殺蟬蝻與殺線蟲組合物，其包含殺昆蟲、殺蟬蝻或殺線蟲有效量之如申請專利範圍第1項所定義之式(I)化合物。

柒、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第 () 圖。

(二)本代表圖之元件代表符號簡單說明：

捌、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

