

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利申请公布说明书

[21] 申请号 200610131898.1

[51] Int. Cl.

C07D 471/10 (2006.01)
C07D 491/10 (2006.01)
C07D 211/76 (2006.01)
C07D 211/70 (2006.01)
A01N 43/90 (2006.01)
A01P 5/00 (2006.01)

[43] 公开日 2007 年 4 月 11 日

[11] 公开号 CN 1944431A

[51] Int. Cl. (续)

A01P 7/00 (2006.01)
C07D 221/00 (2006.01)
C07D 209/00 (2006.01)
C07D 317/00 (2006.01)

[22] 申请日 2003.6.4

[21] 申请号 200610131898.1

分案原申请号 03813854.9

[30] 优先权

[32] 2002.6.14 [33] GB [31] 0213715.6

[71] 申请人 辛根塔有限公司

地址 英国萨里郡

共同申请人 辛根塔参与股份公司

[72] 发明人 D·J·休斯 P·A·沃辛顿

C·A·拉塞尔 E·D·克拉克

J·E·皮斯 M·R·阿斯顿

T·S·库尔特 R·S·罗伯茨

L·P·莫雷尔斯 F·塞德鲍姆

J·卡塞尔 P·梅恩费什

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商
标事务所

代理人 张敏

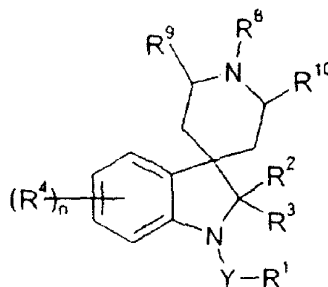
权利要求书 2 页 说明书 134 页

[54] 发明名称

螺二氢吡啶哌啶衍生物

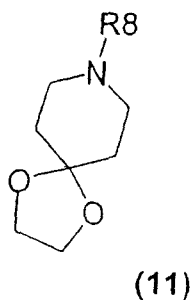
[57] 摘要

结构式(I)的杀虫、杀螨、杀线虫和或杀软体动物的化合物，其中 Y 是单键、C=O、C=S 或 C=(O)_q，其中 q 是 0, 1 或 2；和 R¹, R², R³, R⁴, R⁸, R⁹ 和 R¹⁰ 如权利要求中所定义或其盐或 N-氧化物，制备它们的方法和含有它们的组合物。

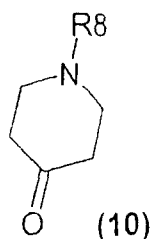


(I)

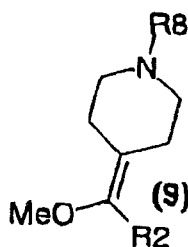
1. 结构式(11)的化合物



其中 R⁸ 是苯基 (C₂₋₄) 链烯基 (其中该苯基被卤素, C₁₋₄ 烷基, C₁₋₄ 烷氧基, C₁₋₄ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代, 前提条件是取代基不是对-氟); 或结构式(10)的化合物



其中 R⁸ 是苯基 (C₂₋₄) 链烯基 (其中该苯基被卤素, C₁₋₄ 烷基, C₁₋₄ 烷氧基, C₁₋₄ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代, 前提条件是取代基不是对-氟); 或结构式(9)的化合物



其中 R^2 与在权利要求 1 中对于结构式 (I) 的定义相同和 R^8 是苯基 (C_{2-4}) 链烯基 (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)。

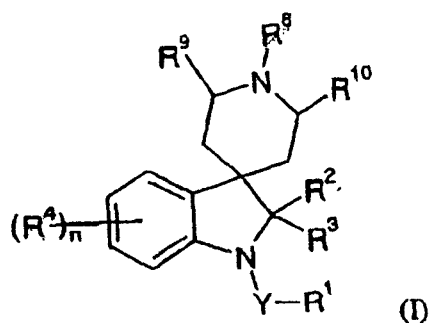
螺二氢吲哚啉衍生物

本申请是中国发明专利申请 No. 03813854.9 的分案申请，要求其在先申请 GB 0213715.6 (2002年6月14日) 的优先权。

本发明涉及螺二氢吲哚啉衍生物，涉及制备它们的方法，涉及包括它们的杀虫、杀螨、杀线虫和杀软体动物组合物，和涉及使用它们抗击和控制害虫、螨虫、软体动物和线虫的方法。

具有药物性能的螺二氢吲哚啉衍生物已公开在例如 US5536716, US4307235, W09825605, W09429309, W09828297 和 W09964002 中。对于具有药物性能的所选择的化合物的合成路线已描述在 Proc. Natl. Acad. Sci. USA(1995), 92, 7001, 四面体(1997), 53, 10983 和四面体通讯(1997), 38, 1497 中。现在令人吃惊地发现某些螺二氢吲哚具有杀虫性能。

本发明因此提供抗击和控制昆虫、螨虫、线虫或软体动物的方法，它包括对害虫，对害虫的生存场所，或对受害虫侵害的植物施用杀昆虫、杀螨虫、杀线虫或杀软体动物有效量的结构式 (I) 的化合物：



式中 Y 是单键，C=O，C=S 或 S(O)_q，其中 q 是 0, 1 或 2；R¹ 是氢，任选取代的烷基，任选取代的烷氧基羰基，任选取代的烷基羰基，氨基羰基，任选取代的烷基氨基羰基，任选取代的二烷基氨基羰基，任选取代的芳基，任选取代的杂芳基，任选取代的烷氧基，任选取代的芳氧基，任选取代的杂芳氧基，任选取代的杂环基氧基，氰基，任选

取代的链烯基, 任选取代的炔基, 任选取代的环烷基, 任选取代的环烯基, 甲酰基, 任选取代的杂环基, 任选取代的烷硫基, NO 或 $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$, 其中 R^{13} 和 R^{14} 独立地是氢, COR^{40} , 任选取代的烷基, 任选取代的芳基, 任选取代的杂芳基, 任选取代的杂环基或 R^{13} 和 R^{14} 与它们所连接的 N 原子一起形成基团 $-\text{N}=\text{C}(\text{R}^{41})-\text{NR}^{42}\text{R}^{43}$; R^2 和 R^3 独立地是氢, 卤素, 氰基, 任选取代的烷基, 任选取代的烷氧基, 任选取代的芳基或 $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$, 其中 R^{15} 和 R^{16} 独立地是氢, 任选取代的烷基, 任选取代的芳基, 任选取代的杂芳基或任选取代的杂环基, 或 R^2 和 R^3 一起是 $=\text{O}$, 或 R^2 和 R^3 与它们所连接的原子一起形成 4、5、6 或 7 元碳环或杂环; R^4 各自独立地是卤素, 硝基, 氰基, 任选取代的 C_{1-8} 烷基, 任选取代的 C_{2-6} 链烯基, 任选取代的 C_{2-6} 炔基, 任选取代的烷氧基羰基, 任选取代的烷基羰基, 任选取代的烷基氨基羰基, 任选取代的二烷基氨基羰基, 任选取代的 C_{3-7} 环烷基, 任选取代的芳基, 任选取代的杂芳基, 任选取代的杂环基, 任选取代的烷氧基, 任选取代的芳氧基, 任选取代的杂芳氧基, 任选取代的烷硫基或 $\text{R}^{19}\text{R}^{20}\text{N}$, 其中 R^{19} 和 R^{20} 独立地是氢, C_{1-8} 烷基, C_{3-7} 环烷基, C_{3-6} 链烯基, C_{3-6} 炔基, C_{3-7} 环烷基 (C_{1-4}) 烷基, C_{2-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷氧基羰基或 R^{19} 和 R^{20} 与它们所连接的 N 原子一起形成五、六或七元杂环, 该杂环它可以含有选自 O、N 或 S 中的一个或两个其它杂原子和它可以任选地被一个或两个 C_{1-6} 烷基取代, 或 2 个相邻基团 R^4 与它们所连接的碳原子一起形成可任选被卤素取代的 4、5、6、或 7 元碳环或杂环; n 是 0, 1, 2, 3 或 4; R^8 是任选取代的烷基, 任选取代的链烯基, 任选取代的炔基, 任选取代的环烷基, 任选取代的芳基, 任选取代的烷氧基, 任选取代的芳氧基, 任选取代的烷氧基羰基, 任选取代的烷基羰基或任选取代的链烯基羰基; R^9 和 R^{10} 独立地是氢, 卤素, 任选取代的烷基, 任选取代的芳基或 R^9 和 R^{10} 一起形成基团 $-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 或 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$; R^{40} 是 H, 任选取代的烷基, 任选取代的烷氧基, 任选取代的芳基, 任选取代的芳氧基, 任选取代的杂芳基, 任选取代的杂芳氧基或 $\text{NR}^{44}\text{R}^{45}$; R^{41} 、 R^{42} 和 R^{43} 各自独立地是 H 或低级烷基; R^{44} 和 R^{45} 独立地是任选取代的烷基, 任选取代的芳

基或任选取代的杂芳基或其盐或 N-氧化物。

结构式 (I) 的化合物能够以不同的几何异构体或旋光异构体或互变异构体的形式存在。本发明覆盖了所有此类异构体和互变异构体和它们按各种比例的混合物以及同位素形式如氘代化合物。

单独或作为较大基团 (如烷氧基, 烷氧基羰基, 烷基羰基, 烷基氨基羰基, 二烷基氨基羰基) 的一部分的各烷基结构部分是直链或支链的并且是, 例如, 甲基, 乙基, 正丙基, 正丁基, 正戊基, 正己基, 异丙基, 正丁基, 仲丁基, 异丁基, 叔丁基或新戊基。

当存在时, 在烷基结构部分 (单独或作为较大基团如烷氧基, 烷氧基羰基, 烷基羰基, 烷基氨基羰基, 二烷基氨基羰基的一部分) 上的任选取代基包括下列基团中的一个或多个: 卤素, 硝基, 氰基, NCS-, C_{3-7} 环烷基 (本身任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代), C_{5-7} 环烯基 (本身任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代), 羟基, C_{1-10} 烷氧基, C_{1-10} 烷氧基 (C_{1-10}) 烷氧基, 三 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基 (C_{1-6}) 烷氧基, C_{1-6} 烷氧基羰基 (C_{1-10}) 烷氧基, C_{1-10} 卤代烷氧基, 芳基 (C_{1-4}) 烷氧基 (其中该芳基任选被取代), C_{3-7} 环烷氧基 (其中该环烷基任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代), C_{2-10} 链烯氧基, C_{2-10} 炔氧基, SH, C_{1-10} 烷硫基, C_{1-10} 卤代烷硫基, 芳基 (C_{1-4}) 烷硫基 (其中该芳基任选被取代), C_{3-7} 环烷基硫基 (其中该环烷基任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代), 三 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基 (C_{1-6}) 烷硫基, 芳硫基 (其中该芳基任选被取代), C_{1-6} 烷基磺酰基, C_{1-6} 卤代烷基磺酰基, C_{1-6} 烷基亚磺酰基, C_{1-6} 卤代烷基亚磺酰基, 芳基磺酰基 (其中该芳基任选被取代), 三 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基, 芳基二 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基, (C_{1-4}) 烷基二芳基甲硅烷基, 三芳基甲硅烷基, C_{1-10} 烷基羰基, HO_2C , C_{1-10} 烷氧基羰基, 氨基羰基, C_{1-6} 烷基氨基羰基, 二 (C_{1-6} 烷基) 氨基羰基, N- (C_{1-3} 烷基) -N- (C_{1-3} 烷氧基) 氨基羰基, C_{1-6} 烷基羰氧基, 芳基羰氧基 (其中该芳基任选被取代), 二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰氧基, 肟如 =NO 烷基, =NO 卤代烷基和 =NO 芳基 (本身任选被取代), 芳基 (本身任选被取代), 杂芳基 (本身任选被取代), 杂环基 (本身任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代), 芳氧基 (其中该芳基任选被取代), 杂芳氧基, (其中该杂芳基任选被取代), 杂环基氧基

(其中该杂环基基团任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代), 氨基, C_{1-6} 烷基氨基, 二(C_{1-6}) 烷基氨基, C_{1-6} 烷基羰基氨基, $N-(C_{1-6})$ 烷基羰基- $N-(C_{1-6})$ 烷基氨基, C_{2-6} 链烯基羰基, C_{2-6} 炔基羰基, C_{3-6} 链烯基氧基羰基, C_{3-6} 炔基氧基羰基, 芳氧基羰基(其中该芳基任选被取代)和芳基羰基(其中该芳基任选被取代)。

链烯基和炔基结构部分能够是直链或支链的形式, 和链烯基结构部分, 如果合适, 能够是(E)-或(Z)-构型。例子是乙烯基, 烯丙基和炔丙基。

当存在时, 在链烯基或炔基上的任选取代基包括以上对于烷基结构部分所给出的那些任选的取代基。

在本说明书的上下文中, 酰基是任选被取代的 C_{1-6} 烷基羰基(例如乙酰基), 任选取代的 C_{2-6} 链烯基羰基, 任选取代的 C_{2-6} 炔基羰基, 任选取代的芳基羰基(例如苯甲酰基)或任选取代的杂芳基羰基。

卤素是氟, 氯, 溴或碘。

卤代烷基基团是被一个或多个相同或不同的卤素原子取代的烷基并且例如, CF_3 , CF_2Cl , CF_3CH_2 或 CHF_2CH_2 。

在本说明书的上下文中术语“芳基”和“芳族环体系”指可以是单-、双-或三环的环体系。此类环的例子包括苯基, 萘基, 蒽基, 茚基或菲基。优选的芳基是苯基。另外, 该术语“杂芳基”、“杂芳族环”或“杂芳族环体系”指含有至少一个杂原子并由单个环或两个或多个稠环组成的芳族环体系。优选, 单环含有至多三个和双环体系含至多四个杂原子, 该杂原子优选是选自氮、氧和硫。此类基团的例子包括咪喃基, 噻吩基, 吡咯基, 吡唑基, 咪唑基, 1,2,3-三唑基, 1,2,4-三唑基, 噁唑基, 异噁唑基, 噻唑基, 异噻唑基, 1,2,3-噁二唑基, 1,2,4-噁二唑基, 1,3,4-噁二唑基, 1,2,5-噁二唑基, 1,2,3-噻二唑基, 1,2,4-噻二唑基, 1,3,4-噻二唑基, 1,2,5-噻二唑基, 吡啶基, 嘧啶基, 哒嗪基, 吡嗪基, 1,2,3-三嗪基, 1,2,4-三嗪基, 1,3,5-三嗪基, 苯并咪喃基, 苯并异咪喃基, 苯并噻吩基, 苯并异噻吩基, 吲哚基, 异氮杂茚基(isoindolyl), 吲唑基, 苯并噻唑基, 苯并异噻

唑基, 苯并噁唑基, 苯并异噁唑基, 苯并咪唑基, 喹啉基, 异喹啉基, 噌啉基, 2,3-二氮杂萘基, 喹唑啉基, 喹喔啉基, 萘啶基, 苯并三嗪基, 嘌呤基, 喋啶基和吲嗪基(indoliziny)。杂芳族基团的优选例子包括吡啶基, 嘧啶基, 三嗪基, 噻吩基, 呋喃基, 噁唑基, 异噁唑基, 和噻唑基。

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

当存在时, 在杂环基上的任选的取代基包括 C_{1-6} 烷基和 C_{1-6} 卤代烷基以及以上对于烷基结构部分所给出的那些任选的取代基。

环烷基包括环丙基、环戊基和环己基。

环烯基包括环戊烯基和环己烯基。

当存在时, 在环烷基或环烯基上的任选的取代基包括 C_{1-3} 烷基以及以上对于烷基结构部分所给出的那些任选的取代基。

碳环包括芳基、环烷基和环烯基。

当存在时, 在芳基或杂芳基上的任选的取代基选独立地选自卤素, 硝基, 氰基, NCS-, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基-(C_{1-6}) 烷基, C_{2-6} 链烯基, C_{2-6} 卤代链烯基, C_{2-6} 炔基, C_{3-7} 环烷基(本身任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代), C_{5-7} 环烯基(本身任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代), 羟基, C_{1-10} 烷氧基, C_{1-10} 烷氧基(C_{1-10}) 烷氧基, 三(C_{1-4}) 烷基-甲硅烷基(C_{1-6}) 烷氧基, C_{1-6} 烷氧基羰基(C_{1-10}) 烷氧基, C_{1-10} 卤代烷氧基, 芳基(C_{1-4}) 烷氧基(其中芳基任选被卤素或 C_{1-6} 烷基取代), C_{3-7} 环烷氧基(其中该环烷基任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代), C_{2-10} 链烯氧基, C_{2-10} 炔氧基, SH, C_{1-10} 烷基硫基, C_{1-10} 卤代烷基硫基, 芳基(C_{1-4}) 烷基硫基, C_{3-7} 环烷基硫基(其中该环烷基任选被 C_{1-6} 烷基或卤素取代), 三(C_{1-4})-烷基甲硅烷基(C_{1-6}) 烷基硫基, 芳基硫基, C_{1-6} 烷基磺酰基, C_{1-6} 卤代烷基磺酰基, C_{1-6} 烷基亚磺酰基, C_{1-6} 卤代烷基亚磺酰基, 芳基磺酰基, 三(C_{1-4}) 烷基甲硅烷基, 芳基二(C_{1-4})-烷基甲硅烷基, (C_{1-4}) 烷基二芳基甲硅烷基, 三芳基甲硅烷基, C_{1-10} 烷基羰基, HO_2C , C_{1-10} 烷氧基羰基, 氨基羰基, C_{1-6} 烷基氨基羰基, 二(C_{1-6}

烷基)-氨基羰基, N-(C₁₋₃ 烷基)-N-(C₁₋₃ 烷氧基)氨基羰基, C₁₋₆ 烷基羰基氧基, 芳基羰基氧基, 二(C₁₋₆)烷基氨基-羰基氧基, 芳基(本身任选被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), 杂芳基(本身任选被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), 杂环基(本身任选被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), 芳氧基(其中该芳基任选被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), 杂芳氧基(其中该杂芳基任选被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), 杂环基氧基(其中该杂环基任选被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), 氨基, C₁₋₆ 烷基氨基, 二(C₁₋₆)烷基氨基, C₁₋₆ 烷基羰基氨基, N-(C₁₋₆)烷基羰基-N-(C₁₋₆)烷基氨基, 芳基羰基, (其中该芳基是其本身任选被卤素或 C₁₋₆ 烷基取代)或在芳基或杂芳基体系上的两个相邻位置可以环化而形成 5、6 或 7 元碳环或杂环, 其本身任选被卤素或 C₁₋₆ 烷基取代。芳基或杂芳基的其它取代基包括芳基羰基氨基(其中该芳基被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), (C₁₋₆)烷基氧基羰基氨基, (C₁₋₆)烷氧基羰基-N-(C₁₋₆)烷基氨基, 芳氧基氧基氨基(其中该芳基被 C₁₋₆ 烷基或卤素), 芳氧基羰基-N-(C₁₋₆)烷基氨基, (其中该芳基被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), 芳基磺酰基氨基(其中该芳基被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), 芳基磺酰基-N-(C₁₋₆)烷基氨基(其中该芳基被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), 芳基 N-(C₁₋₆)烷基氨基(其中该芳基被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), 芳基氨基(其中该芳基被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), 杂芳基氨基(其中该杂芳基被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), 杂环基氨基(其中该杂环基被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), 氨基羰基氨基, C₁₋₆ 烷基氨基羰基氨基, 二(C₁₋₆)烷基氨基羰基氨基, 芳基氨基羰基氨基(其中该芳基被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), 芳基-N-(C₁₋₆)烷基氨基羰基氨基(其中该芳基被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代), C₁₋₆ 烷基氨基羰基-N-(C₁₋₆)烷基氨基, 二(C₁₋₆)烷基氨基羰基-N-(C₁₋₆)烷基氨基, 芳基氨基羰基-N-(C₁₋₆)烷基氨基(其中该芳基被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代)和芳基-N-(C₁₋₆)烷基氨基羰基-N-(C₁₋₆)烷基氨基(其中该芳基被 C₁₋₆ 烷基或卤素取代)。

对于取代的苯基结构部分、杂环基和杂芳基, 优选的是一个或多个取代基独立地选自卤素, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基(C₁₋₆)烷基, C₁₋₆ 烷氧基, C₁₋₆ 卤代烷氧基, C₁₋₆ 烷基硫基, C₁₋₆ 卤代烷基硫基, C₁₋₆ 烷基亚磺酰基, C₁₋₆ 卤代烷基亚磺酰基, C₁₋₆ 烷基磺酰基, C₁₋₆ 卤代烷基

磺酰基, C_{2-6} 链烯基, C_{2-6} 卤代链烯基, C_{2-6} 炔基, C_{3-7} 环烷基, 硝基, 氰基, CO_2H , C_{1-6} 烷基羰基, C_{1-6} 烷氧基羰基, $R^{31}R^{32}N$ 或 $R^{33}R^{34}NC(O)$; 其中 R^{31} 、 R^{32} 、 R^{33} 和 R^{34} 独立地是氢或 C_{1-6} 烷基。进一步优选的取代基是氨基, 二烷基氨基, 芳基和杂芳基。

卤代链烯基是被一个或多个相同的或不同的卤素原子取代的链烯基。

应该理解的是, 二烷基氨基取代基包括这样的一些, 其中二烷基与它们所连接的 N 原子一起形成五、六或七元杂环, 该杂环含有选自 O、N 或 S 中的一个或两个其它杂原子和它任选被一个或两个独立地选择的 (C_{1-6}) 烷基取代。当杂环是通过将两个基团连接在 N 原子上来形成时, 所形成的环适宜是吡咯烷, 哌啶, 硫代吗啉和吗啉, 其中的每一个可以被一个或两个独立地选择的 (C_{1-6}) 烷基取代。

在烷基结构部分上的优选的任选取代基包括下列基团中的一个或多个: 卤素, 硝基, 氰基, HO_2C , C_{1-10} 烷氧基 (本身任选被 C_{1-10} 烷氧基取代), 芳基 (C_{1-4}) 烷氧基, C_{1-10} 烷硫基, C_{1-10} 烷基羰基, C_{1-10} 烷氧基羰基, C_{1-6} 烷基氨基羰基, 二 (C_{1-6} 烷基) 氨基羰基, (C_{1-6}) 烷基羰氧基, 任选取代的苯基, 杂芳基, 芳氧基, 芳基羰基氧基, 杂芳氧基, 杂环基, 杂环基氧基, C_{3-7} 环烷基 (本身任选被 (C_{1-6}) 烷基或卤素取代), C_{3-7} 环烷氧基, C_{5-7} 环烯基, C_{1-6} 烷基磺酰基, C_{1-6} 烷基亚磺酰基, 三 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基, 三 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基 (C_{1-6}) 烷氧基, 芳基二 (C_{1-4}) 烷基甲硅烷基, (C_{1-4}) 烷基二芳基甲硅烷基和三芳基甲硅烷基。

优选地, 在链烯基或炔基上的任选取代基包括下列基团中的一个或多个: 卤素, C_{3-7} 环烷基和芳基; 该芳基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代。

杂环基的优选的任选取代基是 C_{1-6} 烷基。

环烷基的优选的任选取代基包括卤素, 氰基和 C_{1-3} 烷基。

环烯基的优选的任选取代基包括 C_{1-3} 烷基, 卤素和氰基。

一组优选的化合物是结构式 (IA) 的那些化合物, 它们是下述的结

构式(I)的化合物,其中Y是单键、C=O, C=S或S(O)_q,其中q是0, 1或2; R¹是氢,任选取代的烷基,任选取代的烷氧基羰基,任选取代的烷基羰基,氨基羰基,任选取代的烷基氨基羰基,任选取代的二烷基氨基羰基,任选取代的芳基,任选取代的杂芳基,任选取代的烷氧基,任选取代的芳氧基,任选取代的杂芳氧基,任选取代的杂环基氧基,氰基,任选取代的链烯基,任选取代的炔基,任选取代的环烷基,任选取代的环烯基,甲酰基,任选取代的杂环基,任选取代的烷硫基或NR¹³R¹⁴,其中R¹³和R¹⁴独立地是氢,任选取代的烷基,任选取代的芳基,任选取代的杂芳基或任选取代的杂环基; R²和R³独立地是氢,卤素,氰基,任选取代的烷基,任选取代的烷氧基,任选取代的芳基或C(O)NR¹⁵R¹⁶,其中R¹⁵和R¹⁶独立地是氢,任选取代的烷基,任选取代的芳基,任选取代的杂芳基或任选取代的杂环基,或R²和R³一起是=O,或R²和R³与它们所连接的原子一起形成4、5、6或7元碳环或杂环;各R⁴独立地是卤素,硝基,氰基,任选取代的C₁₋₃烷基,任选取代的C₂₋₆链烯基,任选取代的C₂₋₆炔基,任选取代的烷氧基羰基,任选取代的烷基羰基,任选取代的烷基氨基羰基,任选取代的二烷基氨基羰基,任选取代的C₃₋₇环烷基,任选取代的芳基,任选取代的杂芳基,任选取代的杂环基,任选取代的烷氧基,任选取代的芳氧基,任选取代的杂芳氧基,任选取代的烷硫基或R¹⁹R²⁰N,其中R¹⁹和R²⁰独立地是氢,C₁₋₈烷基,C₃₋₇环烷基,C₃₋₆链烯基,C₃₋₆炔基,C₃₋₇环烷基(C₁₋₄)烷基,C₂₋₆卤代烷基,C₁₋₆烷氧基(C₁₋₆)烷基,C₁₋₆烷氧基羰基或R¹⁹和R²⁰与它们所连接的N原子一起形成五、六或七元杂环,该杂环可含有选自O、N或S中的一个或多个其它杂原子和它可以任选地被一个或两个C₁₋₆烷基取代,或2个相邻基团R⁴与它们所连接的碳原子一起形成任选被卤素取代的4、5、6或7元碳环或杂环;n是0, 1, 2, 3或4; R⁸是任选被取代的烷基,任选取代的链烯基,任选取代的炔基,任选取代的环烷基,任选取代的芳基,任选取代的烷氧基,任选取代的芳氧基,任选取代的烷氧基羰基,任选取代的烷基羰基或任选取代的链烯基羰基; R⁹和R¹⁰独立地是氢,卤素,任选取代的烷基,任选取代的芳基或R⁹

和 R^{10} 一起形成基团 $-\text{CH}_2-$, $-\text{CH}=\text{CH}-$ 或 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$; 或它的盐或 N-氧化物。

另一组优选的化合物是结构式 (IB) 的那些化合物, 它们是下述的结构式 (I) 的化合物, 其中 Y 是单键, C=O 和 S(O)_q, 其中 q 是 0, 1 或 2; R^1 是氢, C₁₋₈ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 氰基烷基, C₃₋₇ 环烷基 (C₁₋₆) 烷基, C₅₋₆ 环烯基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷氧基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆ 链烯氧基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆ 炔氧基 (C₁₋₆) 烷基, 芳氧基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 羧基烷基, C₁₋₆ 烷基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₂₋₆ 链烯基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₂₋₆ 炔基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷氧基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆ 链烯基氧基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆ 炔基氧基羰基 (C₁₋₆) 烷基, 芳氧基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷硫基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基亚磺酰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基磺酰基 (C₁₋₆) 烷基, 氨基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基氨基羰基 (C₁₋₆) 烷基, 二 (C₁₋₆) 烷基氨基羰基 (C₁₋₆) 烷基, 苯基 (C₁₋₄) 烷基 (其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄ 烷基, C₁₋₄ 烷氧基, C₁₋₄ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (C₁₋₄) 烷基 (其中该杂芳基可以被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), 杂环基 (C₁₋₄) 烷基 (其中杂环基可以被卤素, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), C₁₋₆ 烷氧基羰基, C₁₋₆ 烷基羰基, 氨基羰基, C₁₋₆ 烷基氨基羰基, 二 (C₁₋₆) 烷基-氨基羰基, 苯基 (任选被卤素, C₁₋₄ 烷基, C₁₋₄ 烷氧基, C₁₋₄ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), C₁₋₆ 烷氧基, C₁₋₆ 卤代烷氧基, 芳氧基 (其中该芳基任选被卤素, C₁₋₄ 烷基, C₁₋₄ 烷氧基, C₁₋₄ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳氧基 (其中该杂芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), 氰基, C₂₋₆ 链烯基, C₂₋₆ 卤代链烯基, C₂₋₆ 氰基链烯基, 氨基羰基 (C₂₋₆) 链烯基, C₁₋₆ 烷基氨基羰基 (C₂₋₆) 链烯基, 二 (C₁₋₆) 烷基氨基羰基 (C₂₋₆) 链烯基, 苯基 (C₂₋₄) 链烯基, (其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄ 烷基, C₁₋₄ 烷氧基, C₁₋₄ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷

基氨基取代), C_{2-6} 炔基, 氨基羰基 (C_{2-6})-炔基, C_{1-6} 烷基氨基羰基 (C_{2-6})-炔基, 二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基 (C_{2-6}) 炔基, C_{3-7} 环烷基, C_{3-7} 卤代环烷基, C_{3-7} 氰基环烷基, C_{1-3} 烷基 (C_{3-7}) 环烷基, C_{1-3} 烷基-(C_{3-7}) 卤代环烷基, C_{5-6} 环烯基, 甲酰基, 杂环基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{1-8} 烷硫基, 或 $R^{13}R^{14}N$, 其中 R^{13} 和 R^{14} 独立地是氢, COR^{40} , C_{1-6} 烷基, 芳基 (任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN , NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (任选被卤素或 C_{1-3} 烷基取代) 或 R^{13} 和 R^{14} 与它们所连接的 N 原子一起形成基团 $-N=C(R^{41})-NR^{42}R^{43}$, 其中 R^{41} 、 R^{42} 和 R^{43} 独立地是 H 或 C_{1-4} 低级烷基; R^2 和 R^3 独立地是氢, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或氰基; 各 R^4 独立地是卤素, 硝基, 氰基, C_{1-8} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 氰基烷基, C_{3-7} 环烷基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷氧基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基氨基羰基 (C_{1-6}) 烷基, 二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基 (C_{1-6}) 烷基, 苯基 (C_{1-6}) 烷基 (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN , NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (C_{1-6}) 烷基 (其中该杂芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{2-6} 链烯基, C_{2-6} 卤代链烯基, C_{2-6} 炔基, C_{1-6} 烷氧基羰基, C_{1-6} 烷基羰基, C_{1-6} 烷基氨基羰基, 二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基, C_{3-7} 环烷基, 苯基 (任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN , NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{1-8} 烷氧基, C_{1-8} 卤代烷氧基, 芳氧基 (其中该芳基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN , NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代) 或杂芳氧基 (其中该杂芳基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN , NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代); n 是 0, 1, 2, 3 或 4; R^8 是任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素、苯基 (本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4}

卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)、杂芳基(本身任选被卤素, C₁₋₄烷基或 C₁₋₄烷氧基取代)取代的 C₁₋₁₀烷基, 任选被 C₁₋₆烷氧基、卤素或苯基(本身任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)取代的 C₂₋₆链烯基, 任选被 C₁₋₆烷氧基、卤素或苯基(本身任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)取代的 C₂₋₆炔基或 -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵, 其中 z 是 1 或 2, R⁵¹和 R⁵²各自独立地是 H, 卤素或 C₁₋₂烷基, R⁵³和 R⁵⁴各自独立地是 H, 卤素, C₁₋₄烷基或 C₁₋₄卤代烷基和 R⁵⁵是芳基(任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)或杂芳基(任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代); R⁹和 R¹⁰独立地是氢, C₁₋₂烷基或卤素; R⁴⁰是 H, C₁₋₆烷基, C₁₋₆卤代烷基, C₁₋₆烷氧基, C₁₋₆卤代烷氧基, 苯氧基(其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 苯基(任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基(任选被卤素, C₁₋₄烷基或 C₁₋₄烷氧基取代), 杂芳氧基(其中该杂芳基任选被卤素, C₁₋₄烷基或 C₁₋₄烷氧基取代)或 NR⁴⁴R⁴⁵, 其中 R⁴⁴和 R⁴⁵独立地是 C₁₋₆烷基(任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆卤代烷基, C₁₋₆烷氧基或 C₁₋₆卤代烷氧基取代), 苯基(任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)或杂芳基(任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆烷基, C₁₋₆卤代烷基, C₁₋₆烷氧基或 C₁₋₆卤代烷氧基取代)和它的盐或 N-氧化物。

另一组的优选化合物是结构式 (IC) 的那些化合物, 它们是下述的结构式 (I) 的化合物, 其中 Y 是单键, C=O 或 S(O)_q, 其中 q 是 0, 1 或 2; R¹ 是氢, C₁₋₈烷基, C₁₋₆卤代烷基, C₁₋₆氰基烷基, C₃₋₇环烷基 (C₁₋₆) 烷基, C₅₋₆环烯基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆烷氧基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆链烯氧基 (C₁₋₆) 烷

基, C₃₋₆ 炔氧基 (C₁₋₆) 烷基, 芳氧基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 羧基烷基, C₁₋₆ 烷基羧基 (C₁₋₆) 烷基, C₂₋₆ 链烯基羧基-(C₁₋₆) 烷基, C₂₋₆ 炔基羧基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷氧基羧基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆ 链烯基氧基羧基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆ 炔基氧基羧基 (C₁₋₆) 烷基, 芳氧基羧基 (C₁₋₆)-烷基, C₁₋₆ 烷硫基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基亚磺酰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基磺酰基 (C₁₋₆) 烷基, 氨基羧基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基氨基羧基 (C₁₋₆) 烷基, 二 (C₁₋₆)-烷基氨基羧基 (C₁₋₆) 烷基, 苯基 (C₁₋₄) 烷基 (其中该苯基任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), 杂芳基 (C₁₋₄) 烷基 (其中该杂芳基可以被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), 杂环基 (C₁₋₄) 烷基 (其中该杂环基可以被卤素, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), C₁₋₆ 烷氧基羧基, C₁₋₆ 烷基羧基, 氨基羧基, C₁₋₆ 烷基氨基羧基, 二 (C₁₋₆) 烷基氨基羧基, 苯基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), 杂芳基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), C₁₋₆ 烷氧基, C₁₋₆ 卤代烷氧基, 芳氧基 (其中该芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), 杂芳基氧基 (其中该杂芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), 氰基, C₂₋₆ 链烯基, C₂₋₆ 卤代链烯基, C₂₋₆ 氰基链烯基, 氨基羧基-(C₂₋₆) 链烯基, C₁₋₆ 烷基氨基羧基 (C₂₋₆) 链烯基, 二 (C₁₋₆) 烷基氨基羧基 (C₂₋₆) 链烯基, 苯基 (C₂₋₄) 链烯基, (其中该苯基任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), C₂₋₆ 炔基, 氨基羧基 (C₂₋₆)-炔基, C₁₋₆ 烷基氨基羧基 (C₂₋₆) 炔基, 二 (C₁₋₆) 烷基氨基羧基 (C₂₋₆) 炔基, C₃₋₇ 环烷基, C₃₋₇ 卤代环烷基, C₃₋₇ 氰基环烷基, C₁₋₃ 烷基 (C₃₋₇) 环烷基, C₁₋₃ 烷基 (C₃₋₇) 卤代环烷基, C₅₋₆ 环烯基, 甲酰基, 杂环基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), C₁₋₈ 烷硫基, 或 R¹³R¹⁴N, 其中 R¹³ 和 R¹⁴ 独立地是氢, C₁₋₆ 烷基, 芳基 (任选被卤素, C₁₋₃ 烷基, 硝基, 氰基, C₁₋₃ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取

代)或杂芳基(任选被卤素或 C₁₋₃ 烷基取代); R² 和 R³ 独立地是氢, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或氰基; 各 R⁴ 独立地是卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₈ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 氰基烷基, C₃₋₇ 环烷基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷氧基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷氧基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基氨基羰基 (C₁₋₆) 烷基, 二 (C₁₋₆) 烷基氨基羰基-(C₁₋₆) 烷基, 苯基 (C₁₋₆) 烷基 (其中该苯基任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), 杂芳基 (C₁₋₆) 烷基 (其中该杂芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), C₂₋₆ 链烯基, C₂₋₆ 卤代链烯基, C₂₋₆ 炔基, C₁₋₆ 烷氧基羰基, C₁₋₆ 烷基羰基, C₁₋₆ 烷基氨基羰基, 二 (C₁₋₆) 烷基氨基羰基, C₃₋₇ 环烷基, 苯基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), 杂芳基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), C₁₋₈ 烷氧基, C₁₋₈ 卤代烷氧基, 芳氧基 (其中该芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代) 或杂芳氧基 (其中该杂芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代); n 是 0, 1, 2, 3 或 4; R⁸ 是任选取代被 C₁₋₆ 烷氧基、卤素或苯基 (本身任选被卤素, C₁₋₄ 烷基或 C₁₋₄ 烷氧基取代) 取代的 C₁₋₁₀ 烷基, 任选被 C₁₋₆ 烷氧基、卤素或苯基 (本身任选被卤素, C₁₋₄ 烷基或 C₁₋₄ 烷氧基取代) 取代的 C₂₋₆ 链烯基或任选被 C₁₋₆ 烷氧基、卤素或苯基 (本身任选被卤素, C₁₋₄ 烷基或 C₁₋₄ 烷氧基取代) 取代的 C₂₋₆ 炔基; R⁹ 和 R¹⁰ 独立地是氢, C₁₋₂ 烷基或卤素; 及其盐或 N-氧化物。

另一组优选的化合物是结构式 (ID) 的那些化合物, 它们是下述的结构式 (I) 的化合物, 其中 Y 是单键或 C=O; R¹ 是氢, C₁₋₈ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 氰基烷基, C₃₋₇ 环烷基 (C₁₋₆) 烷基, C₅₋₆ 环烯基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷氧基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆ 链烯氧基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆ 炔氧基 (C₁₋₆) 烷基, 芳氧基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 羰基烷基, C₁₋₆ 烷基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₂₋₆ 链烯基羰基-(C₁₋₆) 烷基, C₂₋₆ 炔基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷氧基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆ 链烯基氧基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆ 炔基氧基羰基 (C₁₋₆) 烷基, 芳氧基羰

基 (C₁₋₆)-烷基, C₁₋₆ 烷硫基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基亚磺酰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基磺酰基 (C₁₋₆) 烷基, 氨基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基氨基羰基 (C₁₋₆) 烷基, 二 (C₁₋₆) 烷基氨基羰基 (C₁₋₆) 烷基, 苯基 (C₁₋₄) 烷基 (其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄ 烷基, C₁₋₄ 烷氧基, C₁₋₄ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (C₁₋₄) 烷基 (其中该杂芳基可以被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), 杂环基 (C₁₋₄) 烷基 (其中该杂环基可以被卤素, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), C₁₋₆ 烷氧基羰基, C₁₋₆ 烷基羰基, 氨基羰基, C₁₋₆ 烷基氨基羰基, 二 (C₁₋₆) 烷基氨基羰基, 苯基 (任选被卤素, C₁₋₄ 烷基, C₁₋₄ 烷氧基, C₁₋₄ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), C₁₋₆ 烷氧基, C₁₋₆ 卤代烷氧基, 芳氧基 (其中该芳基任选被卤素, C₁₋₄ 烷基, C₁₋₄ 烷氧基, C₁₋₄ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基氧基 (其中该杂芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), 氰基, C₂₋₆ 链烯基, C₂₋₆ 卤代链烯基, C₂₋₆ 氰基链烯基, 氨基羰基-(C₂₋₆) 链烯基, C₁₋₆ 烷基氨基羰基 (C₂₋₆) 链烯基, 二 (C₁₋₆) 烷基氨基羰基 (C₂₋₆) 链烯基; 苯基 (C₂₋₄) 链烯基, (其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄ 烷基, C₁₋₄ 烷氧基, C₁₋₄ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), C₂₋₆ 炔基, 氨基羰基 (C₂₋₆)-炔基, C₁₋₆ 烷基氨基羰基 (C₂₋₆) 炔基, 二 (C₁₋₆) 烷基氨基羰基 (C₂₋₆) 炔基, C₃₋₇ 环烷基, C₃₋₇ 卤代环烷基, C₃₋₇ 氰基环烷基, C₁₋₃ 烷基 (C₃₋₇) 环烷基, C₁₋₃ 烷基-(C₃₋₇) 卤代环烷基, C₅₋₆ 环烯基, 甲酰基, 杂环基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), C₁₋₈ 烷硫基, 或 R¹³R¹⁴N, 其中 R¹³ 和 R¹⁴ 独立地是氢, COR⁴⁰, C₁₋₆ 烷基, 芳基 (任选被卤素, C₁₋₃ 烷基, 硝基, 氰基, C₁₋₃ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), 杂芳基 (任选被卤素或 C₁₋₃ 烷基取代); R² 和 R³ 独立地是氢或甲基, 优选两者是氢; 各 R⁴ 独立地是卤素,

硝基, 氰基, C_{1-8} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 氰基烷基, C_{3-7} 环烷基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷氧基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基氨基羰基 (C_{1-6}) 烷基, 二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基 (C_{1-6}) 烷基, 苯基 (C_{1-6}) 烷基 (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (C_{1-6}) 烷基 (其中该杂芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{2-6} 链烯基, C_{2-6} 卤代链烯基, C_{2-6} 炔基, C_{1-6} 烷氧基羰基, C_{1-6} 烷基羰基, C_{1-6} 烷基氨基羰基, 二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基, C_{3-7} 环烷基, 苯基 (任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{1-8} 烷氧基, C_{1-8} 卤代烷氧基, 芳氧基 (其中该芳基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代) 或杂芳氧基 (其中该杂芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代); n 是 0, 1, 2, 3 或 4; R⁸ 是任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素、苯基 (本身任选被卤素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代)、杂芳基 (本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代) 取代的 C_{1-10} 烷基; 或 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$, 其中 z 是 1 或 2, R⁵¹ 和 R⁵² 各自独立地是 H, 卤素或 C_{1-2} 烷基, R⁵³ 和 R⁵⁴ 各自独立地是 H, 卤素, C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 卤代烷基和 R⁵⁵ 是芳基 (任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代) 或杂芳基 (任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代); R⁹ 和 R¹⁰ 两者都是氢; R⁴⁰ 是 H, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, 苯氧基 (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)

基氨基取代), 苯基(任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基(任选被由卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)或杂芳氧基(任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤素烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)及其盐或 N-氧化物。

又一组优选的化合物是结构式(IE)的那些化合物, 它们是下述的结构式(I)的化合物, 其中 Y, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^8 和 n 与结构式 IC 的化合物的定义相同; R^9 和 R^{10} 独立地是氢, C_{1-2} 烷基和卤素, 和优选全部是氢; 及其盐或 N-氧化物。

又一组的优选化合物是结构式(IF)的那些化合物, 它们是下述的结构式(I)的化合物, 其中 Y, R^1 , R^4 , R^8 , R^9 , R^{10} 和 n 与结构式(IE)的化合物的定义相同以及 R^2 和 R^3 独立地是氢, 卤素, C_{1-2} 烷基, C_{1-2} 卤代烷基, C_{1-2} 烷氧基, 氰基, 或 R^2 和 R^3 一起是=O, 或 R^2 和 R^3 与它们所连接的原子一起形成 4、5、6 或 7 元碳环或杂环; 及其盐或 N-氧化物。

又一组优选的化合物是结构式(IG)的那些化合物, 它们是下述的结构式(I)的化合物, 其中 Y, R^1 , R^2 , R^3 , R^8 , R^9 , R^{10} 和 n 与结构式(IF)的化合物的定义相同和各 R^4 独立地是卤素, 硝基, 氰基, C_{1-8} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 氰基烷基, C_{3-7} 环烷基(C_{1-6})烷基, C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基, C_{1-6} 烷氧基羰基(C_{1-6})烷基, C_{1-6} 烷基羰基(C_{1-6})烷基, C_{1-6} 烷基氨基羰基(C_{1-6})烷基, 二(C_{1-6})烷基氨基羰基(C_{1-6})烷基, 苯基(C_{1-6})烷基(其中该苯基任选被卤素, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, 或 NO_2 取代), 杂芳基(C_{1-6})烷基(其中该杂芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{2-6} 链烯基, C_{2-6} 卤代链烯基, C_{2-6} 炔基, C_{1-6} 烷氧基羰基, C_{1-6} 烷基羰基, C_{1-6} 烷基氨基羰基, 二(C_{1-6})烷基-氨基羰基, C_{3-7} 环烷基, 苯基(任选被卤素, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 取代), 杂芳基(任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{1-8} 烷氧基, C_{1-8} 卤代烷氧基, 芳氧

基(其中该芳基任选被卤素, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, 或 NO_2 取代)或杂芳氧基(其中该杂芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代); 及其盐或 N-氧化物。

再一组的优选化合物是结构式 (IG') 的化合物, 它们是下述的结构式 (I) 的化合物, 其中 Y, R^1 , R^2 , R^3 , R^8 , R^9 , R^{10} 和 n 与对于结构式 (IB) 的化合物的定义相同和各 R^4 独立地是卤素, 硝基, 氰基, C_{1-8} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 氰基烷基, C_{3-7} 环烷基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷氧基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基氨基羰基 (C_{1-6}) 烷基, 二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基 (C_{1-6}) 烷基, 苯基 (C_{1-6}) 烷基(其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (C_{1-6}) 烷基(其中该杂芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{2-6} 链烯基, C_{2-6} 卤代链烯基, C_{2-6} 炔基, C_{1-6} 烷氧基羰基, C_{1-6} 烷基羰基, C_{1-6} 烷基氨基羰基, 二 (C_{1-6}) 烷基-氨基羰基, C_{3-7} 环烷基, 苯基(任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基(任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{1-8} 烷氧基, C_{1-8} 卤代烷氧基, 苯氧基(其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)或杂芳氧基(其中该杂芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代); 及其盐或 N-氧化物。

另一组优选的化合物是结构式 (IH) 的那些化合物, 它们是下述的结构式 (I) 的化合物, 其中 R^2 , R^3 , R^4 , R^8 , R^9 , R^{10} 和 n 与对于结构式 (IG) 的化合物的定义相同和 Y 是单键或 $C=O$; R^1 是 C_{1-8} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 氰基烷基, C_{3-7} 环烷基 (C_{1-6}) 烷基, C_{5-6} 环烯基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6})-烷基, C_{3-6} 链烯氧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{3-6} 炔氧基 (C_{1-6}) 烷基, 芳氧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 羧基烷基, C_{1-6} 烷基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{2-6} 链烯基羰

基 (C₁₋₆) 烷基, C₂₋₆ 炔基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷氧基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆ 链烯基氧基羰基 (C₁₋₆)-烷基, C₃₋₆ 炔基-氧基羰基 (C₁₋₆) 烷基, 芳氧基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷硫基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基亚磺酰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基磺酰基 (C₁₋₆) 烷基, 氨基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基氨基羰基 (C₁₋₆) 烷基, 二 (C₁₋₆) 烷基氨基羰基 (C₁₋₆) 烷基, 苯基 (C₁₋₄) 烷基 (其中该苯基任选被卤素, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 烷氧基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, 或 NO₂ 取代), 杂芳基 (C₁₋₄) 烷基 (其中该杂芳基可以被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), 杂环基 (C₁₋₄) 烷基 (其中该杂环基可以被卤素, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), C₁₋₆ 烷氧基羰基, C₁₋₆ 烷基羰基, 氨基羰基, C₁₋₆ 烷基氨基羰基, 二 (C₁₋₆)-烷基氨基羰基, 苯基 (任选被卤素, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 烷氧基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, 或 NO₂ 取代), 杂芳基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), C₁₋₆ 烷氧基, C₁₋₆ 卤代烷氧基, 芳氧基 (其中该芳基任选被卤素, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 烷氧基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, 或 NO₂ 取代), 氰基, C₂₋₆ 链烯基, C₂₋₆ 卤代链烯基, C₂₋₆ 氰基链烯基, 氨基羰基 (C₂₋₆) 链烯基, C₁₋₆ 烷基氨基羰基 (C₂₋₆)-链烯基, 二 (C₁₋₆) 烷基-氨基羰基 (C₂₋₆) 链烯基, 苯基 (C₂₋₄) 链烯基, (其中该苯基任选被卤素, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 烷氧基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, 或 NO₂ 取代), C₂₋₆ 炔基, 氨基羰基 (C₂₋₆) 炔基, 烷基氨基羰基 (C₂₋₆) 炔基, 二 (C₁₋₆) 烷基氨基-羰基 (C₂₋₆) 炔基, C₃₋₇ 环烷基, C₃₋₇ 卤代环烷基, C₃₋₇ 氰基环烷基, C₁₋₃ 烷基 (C₃₋₇) 环烷基, C₁₋₃ 烷基 (C₃₋₇) 卤代环烷基, C₅₋₆ 环烯基, 甲酰基, 杂环基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), C₁₋₈ 烷硫基或 R¹³R¹⁴N, 其中 R¹³ 和 R¹⁴ 独立地是氢, C₁₋₆ 烷基, 芳基 (任选被卤素, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 烷氧基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, 或 NO₂ 取代) 或杂芳基 (任选被卤素或 C₁₋₃ 烷基取代); 及其盐或 N-氧化物。

另一组优选的化合物是结构式 (IH') 的那些化合物, 它们是下述的结构式 (I) 的化合物, 其中 R², R³, R⁴, R⁸, R⁹, R¹⁰ 和 n 与对于结构式

(IG')的化合物的定义相同和 R^1 是 C_{1-8} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 氰基烷基, C_{3-7} 环烷基 (C_{1-6}) 烷基, C_{5-6} 环烯基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) - 烷基, C_{3-6} 链烯氧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{3-6} 炔氧基 (C_{1-6}) 烷基, 芳氧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 羧基烷基, C_{1-6} 烷基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{2-6} 链烯基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{2-6} 炔基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷氧基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{3-6} 链烯基氧基羰基 (C_{1-6}) - 烷基, C_{3-6} 炔基-氧基羰基 (C_{1-6}) 烷基, 芳氧基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷硫基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基亚磺酰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基磺酰基 (C_{1-6}) 烷基, 氨基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基氨基羰基 (C_{1-6}) 烷基, 二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基 (C_{1-6}) 烷基, 苯基 (C_{1-4}) 烷基 (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基- (C_{1-4}) 烷基 (其中该杂芳基可以被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 杂环基 (C_{1-4}) 烷基 (其中该杂环基可以被卤素, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{1-6} 烷氧基羰基, C_{1-6} 烷基羰基, 氨基羰基, C_{1-6} 烷基氨基羰基, 二 (C_{1-6}) - 烷基氨基羰基, 苯基 (任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, 芳氧基 (其中该芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 氰基, C_{2-6} 链烯基, C_{2-6} 卤代链烯基, C_{2-6} 氰基链烯基, 氨基羰基 (C_{2-6}) 链烯基, C_{1-6} 烷基氨基羰基 (C_{2-6}) - 链烯基, 二 (C_{1-6}) 烷基-氨基羰基 (C_{2-6}) 链烯基, 苯基 (C_{2-4}) 链烯基, (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), C_{2-6} 炔基, 氨基羰基 (C_{2-6}) 炔基, 烷基氨基羰基 (C_{2-6}) 炔基, 二 (C_{1-6}) 烷基氨基-羰基 (C_{2-6}) 炔基, C_{3-7} 环烷基, C_{3-7} 卤代环烷基, C_{3-7} 氰基环烷基, C_{1-3} 烷基 (C_{3-7}) 环烷基, C_{1-3} 烷基 (C_{3-7}) 卤代环烷基, C_{5-6} 环烯基, 甲酰基, 杂环基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{1-8} 烷硫

基或 $R^{13}R^{14}N$ ，其中 R^{13} 和 R^{14} 独立地是氢， C_{1-6} 烷基， COR^{40} ，其中 R^{40} 是 C_{1-6} 烷基羰基氨基，苯基氧基羰基氨基（其中该苯基任选被卤素， C_{1-4} 烷基， C_{1-4} 烷氧基， C_{1-4} 卤代烷基， C_{1-4} 卤代烷氧基，CN， NO_2 ，芳基，杂芳基，氨基或二烷基氨基取代），氨基， C_{1-6} 烷基氨基，苯基氨基（其中该苯基任选被卤素， C_{1-4} 烷基， C_{1-4} 烷氧基， C_{1-4} 卤代烷基， C_{1-4} 卤代烷氧基，CN， NO_2 ，芳基，杂芳基，氨基或二烷基氨基取代）及其盐或 N-氧化物。

又一组优选的化合物是结构式 (IJ) 的那些化合物，它们是下述的结构式 (I) 的化合物，其中 Y， R^1 ， R^2 ， R^3 ， R^4 ， R^9 ， R^{10} 和 n 与对于结构式 (IH) 的化合物的定义相同和 R^8 是任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素和苯基（本身任选被卤素， C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代）取代的 C_{1-10} 烷基，任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素或苯基（本身任选被卤素， C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代）取代的 C_{2-6} 链烯基或任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素或苯基（本身任选被卤素， C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代）取代的 C_{2-6} 炔基；及其盐或 N-氧化物。

又一组优选的化合物是结构式 (IJ') 的那些化合物，它们是下述的结构式 (I) 的化合物，其中 Y， R^1 ， R^2 ， R^3 ， R^4 ， R^9 ， R^{10} 和 n 与对于结构式 (IH') 的化合物的定义相同和 R^8 是任选被苯基或杂芳基（该苯基和杂芳基任选被卤素， C_{1-4} 烷基， C_{1-4} 烷氧基， C_{1-4} 卤代烷基， C_{1-4} 卤代烷氧基，CN， NO_2 ，芳基，杂芳基，氨基或二烷基氨基取代）取代的 C_{1-6} 烷基；或 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$ ，其中 z 是 1 或 2， R^{51} 和 R^{52} 各自独立地是 H，卤素或 C_{1-2} 烷基， R^{53} 和 R^{54} 各自独立地是 H，卤素， C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 卤代烷基和 R^{55} 是被卤素， C_{1-4} 烷基， C_{1-4} 烷氧基， C_{1-4} 卤代烷基， C_{1-4} 卤代烷氧基，CN， NO_2 ，芳基，杂芳基，氨基或二烷基氨基取代的芳基，或被卤素， C_{1-4} 烷基， C_{1-4} 烷氧基， C_{1-4} 卤代烷基， C_{1-4} 卤代烷氧基，CN， NO_2 ，芳基，杂芳基，氨基或二烷基氨基取代的杂芳基。

又另一组优选的组化合物是结构式 (IK) 的那些化合物，它们是下述的结构式 (I) 的化合物，其中 Y 是单键， $C=O$ 或 $S(O)_q$ ，其中 q 是 0，1 或 2； R^1 是 C_{1-8} 烷基， C_{1-6} 卤代烷基， C_{1-6} 氰基烷基， C_{3-7} 环烷基 (C_{1-6}) 烷基， C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基， C_{3-6} 链烯氧基- (C_{1-6}) 烷基， C_{3-6} 炔氧基 (C_{1-6})

烷基, 芳氧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 羧基烷基, C_{1-6} 烷基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{2-6} 链烯基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{2-6} 炔基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷氧基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{3-6} 链烯基氧基羰基 (C_{1-6})-烷基, C_{3-6} 炔基氧基羰基 (C_{1-6}) 烷基, 芳氧基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷硫基 (C_{1-6})-烷基, C_{1-6} 烷基亚磺酰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基磺酰基 (C_{1-6}) 烷基, 氨基羰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基氨基羰基 (C_{1-6}) 烷基, 二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基 (C_{1-6}) 烷基, 苯基 (C_{1-4}) 烷基 (其中该苯基任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 杂芳基 (C_{1-4}) 烷基 (其中该杂芳基可以被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 杂环基 (C_{1-4}) 烷基 (其中该杂环基可以被卤素, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 苯基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 杂芳基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, C_{2-6} 链烯基, C_{2-6} 卤代链烯基, C_{2-6} 氰基链烯基, C_{2-6} 炔基, C_{3-7} 环烷基, 甲酰基, 杂环基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代) 或 C_{1-6} 烷硫基; R^2 和 R^3 独立地是氢或 C_{1-4} 烷基; 各 R^4 独立地是卤素, 氰基, 任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素、苯基 (本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代) 取代的 C_{1-10} 烷基, 任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素、苯基 (本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代) 取代的 C_{2-6} 链烯基或任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素、苯基 (本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代) 取代的 C_{2-6} 炔基; n 是 0, 1, 2, 3 或 4; R^8 是任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素或苯基 (本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代) 取代的 C_{1-10} 烷基, 任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素或苯基 (本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代) 取代的 C_{2-6} 链烯基或任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素或苯基 (本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代) 取代的 C_{2-6} 炔基; R^9 和 R^{10} 两者都是氢; 及其盐或 N-氧化物。

又一组优选的组化合物是结构式 (II) 的那些化合物, 它们是下述的结构式 (I) 的化合物, 其中 Y 是单键或 C=O; R^1 是 C_{1-8} 烷基, C_{1-6} 卤代

烷基, C_{1-6} 氰基烷基, C_{3-7} 环烷基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{3-6} 链烯氧基- (C_{1-6}) 烷基, C_{3-6} 炔氧基 (C_{1-6}) 烷基, 芳氧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 羧基烷基, C_{1-6} 烷基羧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{2-6} 链烯基羧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{2-6} 炔基羧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷氧基羧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{3-6} 链烯基氧基羧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{3-6} 炔基氧基羧基 (C_{1-6}) 烷基, 芳氧基羧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基硫基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基亚磺酰基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基磺酰基 (C_{1-6}) 烷基, 氨基羧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基氨基羧基 (C_{1-6}) 烷基, 二 (C_{1-6}) 烷基氨基羧基 (C_{1-6}) 烷基, 苯基 (C_{1-4}) 烷基 (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基- (C_{1-4}) 烷基 (其中该杂芳基可以被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 杂环基 (C_{1-4}) 烷基 (其中该杂环基可以被卤素, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 苯基 (任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, C_{2-6} 链烯基, C_{2-6} 卤代链烯基, C_{2-6} 氰基链烯基, C_{2-6} 炔基, C_{3-7} 环烷基, 甲酰基, 杂环基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代) 或 C_{1-6} 烷硫基, C_{1-6} 烷基羧基氨基, 苯基氧基羧基氨基 (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 氨基, C_{1-6} 烷基氨基, 苯基氨基 (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤素烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代); R^2 和 R^3 独立地是氢或 C_{1-4} 烷基; 各 R^4 独立地是卤素, 氰基, 任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素、苯基 (本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代) 取代的 C_{1-10} 烷基, 任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素、苯基 (本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂

芳基, 氨基或二烷基氨基取代) 取代的 C_{2-6} 链烯基或任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素、苯基(本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代) 取代的 C_{2-6} 炔基; n 是 0, 1, 2, 3 或 4; R^8 是任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素或苯基(本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代) 取代的 C_{1-10} 烷基, 任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素或苯基(本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代) 取代的 C_{2-6} 链烯基或任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素或苯基(本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代) 取代的 C_{2-6} 炔基, 或 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$, 其中 z 是 1 或 2, R^{51} 和 R^{52} 各自独立地是 H, 卤素或 C_{1-2} 烷基, R^{53} 和 R^{54} 各自独立地是 H, 卤素, C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 卤代烷基和 R^{55} 是被卤素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 卤代烷基、 C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代的苯基或被卤素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 卤代烷基、 C_{1-4} 卤代烷氧基、CN、 NO_2 、芳基、杂芳基、氨基或二烷基氨基取代的杂芳基; R^{40} 是 H, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, 苯氧基(其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 苯基(任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基(任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代) 或杂芳氧基(任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代); R^9 和 R^{10} 两者都是氢或甲基; 及其盐或 N-氧化物。

甚至更优选的一组化合物是结构式 (IM) 的那些化合物, 它们是下述的结构式 (I) 的化合物, 其中 Y 是单键或 $C=O$; R^1 是 C_{1-8} 烷基, C_{1-6} 卤

代烷基, C_{1-6} 氰基烷基, C_{3-7} 环烷基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{3-6} 链烯氧基- (C_{1-6})-烷基, C_{3-6} 炔氧基 (C_{1-6}) 烷基, 芳氧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 羧基烷基, C_{1-6} 烷基羧基- (C_{1-6}) 烷基, C_{2-6} 链烯基羧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{2-6} 炔基羧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷氧基羧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{3-6} 链烯基氧基羧基 (C_{1-6})-烷基, C_{3-6} 炔基氧基羧基 (C_{1-6}) 烷基, 芳氧基羧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷硫基 (C_{1-6})-烷基, C_{1-6} 烷基亚磺酰基 (C_{1-6})-烷基, C_{1-6} 烷基磺酰基 (C_{1-6}) 烷基, 氨基羧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{1-6} 烷基氨基羧基 (C_{1-6})-烷基, 二 (C_{1-6}) 烷基氨基羧基 (C_{1-6}) 烷基, 苯基 (C_{1-4}) 烷基 (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (C_{1-4}) 烷基 (其中该杂芳基可以被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 杂环基 (C_{1-4}) 烷基 (其中该杂环基可以被卤素, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 苯基 (任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, C_{2-6} 链烯基, C_{2-6} 卤代链烯基, C_{2-6} 氰基链烯基, C_{2-6} 炔基, C_{3-7} 环烷基, 甲酰基, 杂环基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代) 或 C_{1-6} 烷硫基, C_{1-6} 烷基羧基氨基, 苯基氧基羧基氨基 (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 氨基, C_{1-6} 烷基氨基, 苯基氨基 (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代); R^2 和 R^3 独立地是氢或甲基, 优选两者是氢; 各 R^4 独立地是卤素, 氰基, 任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素、苯基 (本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代) 取代的 C_{1-10} 烷基, 任选被 C_{1-6} 烷氧基、卤素、苯基 (本身任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN,

NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)取代的 C₂₋₆链烯基或任选被 C₁₋₆烷氧基、卤素、苯基(本身任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)取代的 C₂₋₆炔基; n 是 0, 1, 2, 3 或 4; R⁸ 是苯基(C₁₋₄)烷基(其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基(C₁₋₄)烷基(其中该杂芳基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=]_z-R⁵⁵, 其中 z 是 1 或 2 和更优选 z 是 1, R⁵¹ 和 R⁵² 各自独立地是 H, 卤素或 C₁₋₂烷基, R⁵³ 和 R⁵⁴ 各自独立地是 H, 卤素, C₁₋₄烷基或 C₁₋₄卤代烷基和 R⁵⁵ 是被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代的苯基或被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代的杂芳基; R⁴⁰ 是 H, C₁₋₆烷基, C₁₋₆卤代烷基, C₁₋₆烷氧基, C₁₋₆卤代烷氧基, 苯氧基(其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 苯基(任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基(任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)或杂芳氧基(任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)及其盐或 N-氧化物。

优选的是, Y 是单键, C=O, C=S 或 S(O)_q, 其中 q 是 0, 1 或 2。

更优选, Y 是单键, C=O 或 SO₂。

最优选, Y 是单键或 C=O, 尤其 C=O。

R¹ 优选是氢, C₁₋₆烷基, C₁₋₆氰基烷基, C₁₋₆卤代烷基, C₃₋₇环烷基(C₁₋₄)烷基, C₁₋₆烷氧基(C₁₋₆)烷基, 杂芳基(C₁₋₆)烷基(其中该杂芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆烷基, C₁₋₆卤代烷基, C₁₋₆烷氧基, C₁₋₆卤代烷氧基

基, C₁₋₆烷基磺酰基, C₁₋₆烷基亚磺酰基, C₁₋₆烷基硫基, C₁₋₆烷基羰基, C₁₋₆烷基羰基氨基, 芳基羰基取代, 或在杂芳基体系上的两个相邻位置可以环化而形成5、6或7元碳环或杂环, 其本身任选被卤素取代), 芳基(C₁₋₆)烷基(其中该芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆烷基, C₁₋₆卤代烷基, C₁₋₆烷氧基, C₁₋₆卤代烷氧基, C₁₋₆烷基磺酰基, C₁₋₆烷基亚磺酰基, C₁₋₆烷基硫基, C₁₋₆烷基羰基, C₁₋₆烷基羰基氨基, 芳基羰基所取代, 或在杂芳基体系上的两个相邻位置可以环化而形成5、6或7元碳环或杂环, 其本身任选被卤素取代), C₁₋₆烷基羰基氨基(C₁₋₆)烷基, 芳基(它任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆烷基, C₁₋₆卤代烷基, C₁₋₆烷氧基, C₁₋₆卤代烷氧基, C₁₋₆烷基磺酰基, C₁₋₆烷基亚磺酰基, C₁₋₆烷基硫基, C₁₋₆烷基羰基, C₁₋₆烷基羰基氨基, 芳基羰基所取代, 或在杂芳基体系上的两个相邻位置可以环化而形成5、6或7元碳环或杂环, 其本身任选被卤素取代), 杂芳基(它任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆烷基, C₁₋₆卤代烷基, C₁₋₆烷氧基, C₁₋₆卤代烷氧基, C₁₋₆烷基磺酰基, C₁₋₆烷基亚磺酰基, C₁₋₆烷基硫基, C₁₋₆烷基羰基, C₁₋₆烷基羰基氨基, 芳基羰基所取代, 或在杂芳基体系上的两个相邻位置可以环化而形成5、6或7元碳环或杂环, 其本身任选被卤素取代), C₁₋₆烷氧基, C₁₋₆卤代烷氧基, 苯氧基(其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳氧基(任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆烷基, C₁₋₆卤代烷基, C₁₋₆烷氧基或C₁₋₆卤代烷氧基取代), 杂环基氧基(任选被卤素, C₁₋₆烷基, C₁₋₆卤代烷基, C₁₋₆烷氧基或C₁₋₆卤代烷氧基取代), 氰基, C₂₋₆链烯基, C₂₋₆炔基, C₃₋₆环烷基, C₅₋₇环烯基, 杂环基(任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆烷基, C₁₋₆卤代烷基, C₁₋₆烷氧基或C₁₋₆卤代烷氧基取代), C₁₋₆烷基硫基, C₁₋₆卤代烷基硫基或NR¹³R¹⁴, 其中R¹³和R¹⁴独立地是氢, C₂₋₆烷基, C₂₋₆卤代烷基, 苯基(它任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基, 二烷基氨基或C₁₋₄烷氧基羰基取代)或杂芳基(它任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₆烷基, C₁₋₆卤代烷基, C₁₋₆烷氧基或C₁₋₆卤代烷氧基取代), C₁₋₄烷氧基羰基 C₁₋₆烷

基羰基氨基, 苯基氧基羰基氨基(其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 氨基, C_{1-6} 烷基氨基或苯基氨基(其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)。

更优选 R^1 是氢, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基, 杂芳基 (C_{1-6}) 烷基(其中该杂芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, C_{1-6} 烷基磺酰基, C_{1-6} 烷基亚磺酰基, C_{1-6} 烷基硫基, C_{1-6} 烷氧基羰基, C_{1-6} 烷基羰基氨基, 芳基羰基所取代, 或在杂芳基体系上的两个相邻位置可以环化而形成 5、6 或 7 元碳环或杂环, 其本身任选被卤素取代), 苯基 (C_{1-6}) 烷基(其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基, C_{1-6} 烷基磺酰基, C_{1-6} 烷基亚磺酰基, C_{1-6} 烷基硫基, C_{1-6} 烷氧基羰基, C_{1-6} 烷基羰基氨基, 芳基羰基所取代, 或在苯基环上的两个相邻位置可以环化而形成 5、6 或 7 元碳环或杂环, 其本身任选被卤素取代), C_{1-6} 烷基羰基氨基 (C_{1-6}) 烷基, 苯基(它任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基, C_{1-6} 烷基磺酰基, C_{1-6} 烷基亚磺酰基, C_{1-6} 烷基硫基, C_{1-6} 烷氧基羰基, C_{1-6} 烷基羰基氨基, 芳基羰基所取代, 或在苯基环上的两个相邻位置可以环化而形成 5、6 或 7 元碳环或杂环, 其本身任选被卤素取代), 杂芳基(它任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, C_{1-6} 烷基磺酰基, C_{1-6} 烷基亚磺酰基, C_{1-6} 烷基硫基, C_{1-6} 烷氧基羰基, C_{1-6} 烷基羰基氨基, 芳基羰基所取代, 或在杂芳基体系上的两个相邻位置可以环化而形成 5、6 或 7 元碳环或杂环, 其本身任选被卤素取代), C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, 苯氧基(其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳氧基(任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 杂环基氧

基(任选被卤素, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 氰基, C_{2-6} 链烯基, C_{3-6} 环烷基, C_{5-7} 环烯基, 杂环基(任选被卤素, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{1-6} 烷硫基, C_{1-6} 卤代烷硫基, $NR^{13}R^{14}$, 其中 R^{13} 和 R^{14} 独立地是氢, COR^{40} , C_{2-6} 烷基, C_{2-6} 卤代烷基, 苯基(它任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN , NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基, 二烷基氨基, C_{1-4} 烷氧基羰基取代)或杂芳基(它任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, C_{1-4} 烷氧基羰基取代); C_{1-6} 烷基羰基氨基, 苯基氧基羰基氨基(其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN , NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 氨基, C_{1-6} 烷基氨基, 苯基氨基(其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN , NO_2 , 芳基, 杂芳基氨基或二烷基氨基取代)。

更优选, R^1 是 C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6})烷基, 杂芳基(C_{1-3})烷基(其中该杂芳基任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, C_{1-6} 烷基磺酰基, C_{1-6} 烷氧基羰基所取代, 或在杂芳基体系上的两个相邻位置可以环化而形成5、6或7元碳环或杂环, 其本身任选被卤素取代), 苯基(C_{1-3})烷基(其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN , NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基, 二烷基氨基, C_{1-6} 烷基磺酰基, C_{1-6} 烷氧基羰基所取代, 或在苯基环上的两个相邻位置可以环化而形成5、6或7元碳环或杂环, 其本身任选被卤素取代), 苯基(它任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN , NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基, 二烷基氨基, C_{1-6} 烷基磺酰基, C_{1-6} 烷氧基羰基所取代, 或在苯基环上的两个相邻位置可以环化而形成5、6或7元碳环或杂环, 其本身任选被卤素取代), 杂芳基(它任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, C_{1-6} 烷基磺酰基, C_{1-6} 烷氧基羰基所取代, 或在杂芳基体系上的两个相邻位置可以环化而形成5、6或7元碳环或杂环, 其本身任选被卤素取代),

C₁₋₆ 烷氧基, C₁₋₆ 卤代烷氧基, C₂₋₆ 链烯基, 杂环基 (任选被卤素, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, C₁₋₆ 烷氧基或 C₁₋₆ 卤代烷氧基取代), C₁₋₆ 烷硫基, C₁₋₆ 卤代烷硫基或 NR¹³R¹⁴, 其中 R¹³ 和 R¹⁴ 独立地是氢, C₂₋₆ 烷基或 C₂₋₆ 卤代烷基, C₂₋₆ 烷基羰基或苯基羰基, (其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄ 烷基, C₁₋₄ 烷氧基, C₁₋₄ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)。

再更优选, R¹ 是 C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基, 杂芳基 (C₁₋₃) 烷基 (其中该杂芳基任选被卤素, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基取代), 其中该杂芳基是吡啶, 嘧啶, 吡嗪或哒嗪环, 杂芳基 (任选被卤素, 氰基, C₁₋₆ 烷基, C₁₋₆ 卤代烷基取代), 其中该杂芳基是吡啶, 嘧啶, 吡嗪或哒嗪环, C₁₋₆ 烷氧基或杂环基 (任选被卤素, 氰基, C₁₋₃ 烷基, C₁₋₃ 卤代烷基, 或 C₁₋₃ 烷氧基取代)。

最优选 R¹ 是吡啶基 (任选被卤素, C₁₋₃ 烷基或 C₁₋₃ 卤代烷基取代) 或 C₁₋₆ 烷氧基, 尤其卤素-取代的吡啶基。

优选的是, R² 和 R³ 独立地是氢或 C₁₋₄ 烷基。

更优选, R² 和 R³ 独立地是氢或甲基。

甚至更优选, R² 是氢和 R³ 是氢或甲基;

最优选, R² 和 R³ 两者都是氢。

优选各 R⁴ 独立地是卤素, 氰基, C₁₋₈ 烷基, C₁₋₈ 卤代烷基, C₁₋₆ 氰基烷基, C₁₋₆ 烷氧基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₇ 环烷基 (C₁₋₆) 烷基, C₅₋₆ 环烯基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆ 链烯氧基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆ 炔氧基 (C₁₋₆) 烷基, 芳氧基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 羧基烷基, C₁₋₆ 烷基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₂₋₆ 链烯基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₂₋₆ 炔基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷氧基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆ 链烯基氧基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₃₋₆ 炔基氧基羰基 (C₁₋₆) 烷基, 芳氧基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷硫基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基亚磺酰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基磺酰基 (C₁₋₆) 烷基, 氨基羰基 (C₁₋₆) 烷基, C₁₋₆ 烷基氨基羰基 (C₁₋₆) 烷基, 二 (C₁₋₆) 烷基氨基羰基 (C₁₋₆) 烷基, 苯基 (C₁₋₄) 烷基 (其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄ 烷基, C₁₋₄ 烷氧基, C₁₋₄ 卤代烷基, C₁₋₄ 卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (C₁₋₄) 烷基 (其中该杂芳基任选被卤

素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 杂环基 (C_{1-4}) 烷基 (其中该杂环基任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{2-6} 链烯基, 氨基羰基 (C_{2-6}) 链烯基, C_{1-6} 烷基氨基羰基 (C_{2-6}) 链烯基, 二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基 (C_{2-6}) 链烯基, 苯基 (C_{2-4})-链烯基, (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), C_{2-6} 炔基, 三甲基甲硅烷基 (C_{2-6}) 炔基, 氨基羰基 (C_{2-6}) 炔基, C_{1-6} 烷基氨基羰基 (C_{2-6}) 炔基, 二 (C_{1-6}) 烷基氨基羰基 (C_{2-6}) 炔基, C_{1-6} 烷氧基羰基, C_{3-7} 环烷基, C_{3-7} 卤代环烷基, C_{3-7} 氰基环烷基, C_{1-3} 烷基 (C_{3-7})-环烷基, C_{1-3} 烷基 (C_{3-7}) 卤代环烷基, 苯基 (任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 杂环基 (其中该杂环基任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 或 2 个相邻基团 R^4 与它们所连接的碳原子一起形成 4、5、6 或 7 元碳环或杂环, 该碳环或杂环任选被卤素, C_{1-8} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, 苯氧基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), 杂芳氧基 (任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{1-8} 烷硫基或 $R^{19}R^{20}N$ 所取代, 其中 R^{19} 和 R^{20} 独立地是氢, C_{1-8} 烷基, C_{3-7} 环烷基, C_{3-6} 链烯基, C_{3-6} 炔基, C_{2-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基羰基或 R^{19} 和 R^{20} 与它们所连接的 N 原子一起形成五、六或七元杂环, 该杂环可以含有选自 O、N 或 S 中的一个或两个其它杂原子和它可以任选地被一个或两个 C_{1-6} 烷基取代; n 是 0, 1, 2, 3 或 4。

更优选, 各 R^4 独立地是卤素, 氰基, C_{1-8} 烷基, C_{1-8} 卤代烷基, C_{1-8} 氰基烷基, C_{1-6} 烷氧基 (C_{1-6}) 烷基, C_{2-6} 炔基, 三甲基甲硅烷基 (C_{2-6}) 炔基, C_{1-6} 烷氧基羰基, C_{3-7} 环烷基, C_{1-3} 烷基 (C_{3-7}) 环烷基, 苯基 (任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基,

杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂环基(任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代), C_{1-8} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, 苯氧基(任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳氧基(任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-3} 烷基, C_{1-3} 卤代烷基, C_{1-3} 烷氧基或 C_{1-3} 卤代烷氧基取代), 二(C_{1-8}) 烷基氨基, 或 2 个相邻基团 R^4 与它们所连接的碳原子一起形成任选被卤素取代的 4、5、6 或 7 元碳环或杂环; n 是 0, 1, 2, 3 或 4。

更优选, 各 R^4 独立地是卤素, 氰基, C_{1-8} 烷基, C_{1-8} 卤代烷基, C_{1-8} 氰基烷基, C_{1-6} 烷氧基(C_{1-6}) 烷基, C_{2-6} 炔基, 杂环基(任选被 C_{1-6} 烷基取代), C_{1-8} 烷氧基, C_{1-6} 卤代烷氧基, 苯氧基(任选被卤素, 氰基, C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 卤代烷基取代), 杂芳氧基(任选被卤素, 氰基, C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 卤代烷基取代), 二(C_{1-8}) 烷基氨基或 2 个相邻基团 R^4 与它们所连接的碳原子一起形成任选被卤素取代的 4、5、6 或 7 元碳环或杂环; n 是 0, 1, 2, 3 或 4;

再更优选, 各 R^4 独立地是氟, 氯, 溴, 氰基, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 氰基烷基或 C_{1-3} 烷氧基(C_{1-3}) 烷基; n 是 0, 1 或 2;

最优选, 各 R^4 独立地是氟, 氯, 溴, C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 卤代烷基; n 是 1 或 2。

优选 R^8 是 C_{1-10} 烷基, C_{1-10} 卤代烷基, 芳基(C_{1-6}) 烷基(其中该芳基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基(C_{1-6}) 烷基(其中该杂芳基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 芳基羰基-(C_{1-6}) 烷基(其中该芳基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代和该烷基任选被芳基取代), C_{2-8} 链烯基, C_{2-8} 卤代链烯基, 芳基(C_{2-6})-链烯基(其中该芳基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基,

C₁₋₆烷氧基羰基所取代, 或两个相邻的取代基能够环化而形成 5、6 或 7 元碳环或杂环), C₂₋₆炔基, 苯基 (C₂₋₆) 炔基 (其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), C₃₋₇环烷基, C₁₋₆烷氧基羰基, C₁₋₆烷基羰基, C₁₋₆卤代烷基羰基或芳基 (C₂₋₆) 链烯基羰基 (其中该芳基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 或 -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵, 其中 z 是 1 或 2, R⁵¹和 R⁵²各自独立地是 H, 卤素或 C₁₋₂烷基, R⁵³和 R⁵⁴各自独立地是 H, 卤素, C₁₋₄烷基或 C₁₋₄卤代烷基和 R⁵⁵是任选被取代的芳基或任选被取代的杂芳基。

R⁸更优选是 C₁₋₆烷基, C₁₋₆卤代烷基, 芳基 (C₁₋₄) 烷基 (其中该芳基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (C₁₋₆) 烷基 (其中该杂芳基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), C₂₋₆链烯基, 芳基 (C₂₋₆) 链烯基 (其中该芳基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), C₂₋₆炔基, 苯基 (C₂₋₆) 炔基 (其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代); 或 -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵, 其中 z 是 1 或 2, R⁵¹和 R⁵²各自独立地是 H, 卤素或 C₁₋₂烷基, R⁵³和 R⁵⁴各自独立地是 H, 卤素, C₁₋₄烷基或 C₁₋₄卤代烷基和 R⁵⁵是任选被取代的芳基或任选被取代的杂芳基。

甚至更优选, R⁸是苯基 (C₁₋₄) 烷基 (其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 (C₁₋₆) 烷基 (其中该杂芳基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 苯基 (C₂₋₆) 链烯基 (其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基,

CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代)或苯基(C₂₋₆)炔基(其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 或 -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵, 其中 z 是 1 或 2, R⁵¹和 R⁵²各自独立地是 H, 卤素或 C₁₋₂烷基, R⁵³和 R⁵⁴各自独立地是 H, 卤素, C₁₋₄烷基或 C₁₋₄卤代烷基和 R⁵⁵是任选被取代的芳基或任选被取代的杂芳基。

更优选 R⁸是苯基 CH₂- (其中该苯基任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 CH₂- (其中该杂芳基是任选被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代的双环基团), 或 -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=]_z-R⁵⁵, 其中 z 是 1 或 2, R⁵¹和 R⁵²各自独立地是 H, 卤素或 C₁₋₂烷基, R⁵³和 R⁵⁴各自独立地是 H, 卤素, C₁₋₄烷基或 C₁₋₄卤代烷基和 R⁵⁵是任选被取代的芳基或任选被取代的杂芳基。

再更优选, R⁸是苯基(C₂₋₄)链烯基(其中该苯基任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₃烷基, C₁₋₃卤代烷基, C₁₋₃烷氧基, C₁₋₃烷氧基羰基或 C₁₋₃卤代烷氧基取代)或苯基(C₂₋₄)炔基(其中该苯基任选被卤素, 硝基, 氰基, C₁₋₃烷基, C₁₋₃卤代烷基, C₁₋₃烷氧基, C₁₋₃烷氧基羰基或 C₁₋₃卤代烷氧基取代); 或 R⁸是 -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵, 其中 z 是 1 或 2, R⁵¹和 R⁵²各自独立地是 H, 卤素或 C₁₋₂烷基, R⁵³和 R⁵⁴各自独立地是 H, 卤素, C₁₋₄烷基或 C₁₋₄卤代烷基和 R⁵⁵是被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代的苯基或被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代的杂芳基。

最优选, R⁸是 -C(R⁵¹)(R⁵²)-[CR⁵³=CR⁵⁴]_z-R⁵⁵, 其中 z 是 1 或 2, 优选 1, R⁵¹和 R⁵²各自独立地是 H, 卤素或 C₁₋₂烷基, R⁵³和 R⁵⁴各自独立地是 H, 卤素, C₁₋₄烷基或 C₁₋₄卤代烷基和 R⁵⁵是被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷基, C₁₋₄卤代烷氧基, CN, NO₂, 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代的苯基或被卤素, C₁₋₄烷基, C₁₋₄烷氧基, C₁₋₄卤代烷

基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代的杂芳基。

优选的是 R^9 和 R^{10} 两者都是氢。

R^{51} 和 R^{52} 优选是氢。

R^{53} 和 R^{54} 优选是氢或卤素, 尤其氢。

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

结构式 (I) 的某些化合物是新的, 因此构成了本发明的又一方面。例如提供了如以上所定义的结构式 (IK) 的新型化合物和它们的盐或 N-氧化物, 前提条件是 R^8 不是甲基和 YR^1 不是 SO_2CH_3 , 甲基, 乙基, 苯基或氟取代的苯基。

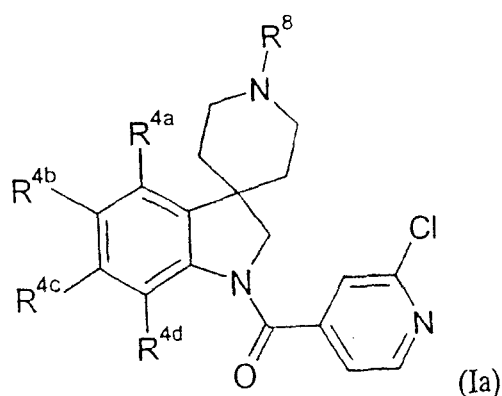
其它新型化合物是结构式 IN 的那些化合物, 它们是下述的结构式 I 的化合物, 其中 Y 是单键或 $C=O$; R^1 是 C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, 杂芳基 (C_{1-3}) 烷基 (其中该杂芳基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代和该杂芳基是吡啶, 嘧啶, 吡嗪或哒嗪环), 杂芳基 (任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代和其中该杂芳基是吡啶, 嘧啶, 吡嗪或哒嗪环), C_{1-6} 烷氧基或杂环基 (任选被卤素, 氟基, C_{1-3} 烷基, C_{1-3} 卤代烷基, 或 C_{1-3} 烷氧基取代); R^4 独立地是氟, 氯, 溴, 氰基, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 氰基烷基或 C_{1-3} 烷氧基 (C_{1-3}) 烷基; n 是 0, 1 或 2; R^8 是苯基 (C_{2-4}) 链烯基 (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基, 二烷基氨基或 C_{1-3} 烷氧基羰基取代) 或苯基 (C_{2-4}) 炔基 (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基, 二烷基氨基或 C_{1-3} 烷氧基羰基取代) 和 R^2 , R^3 , R^9 和 R^{10} 全部是氢。

其它新型化合物是结构式 IP 的那些化合物, 它们是下述的结构式

(I)的化合物, 其中 Y 是 C(O); R^1 是吡啶基(任选被卤素、 C_{1-3} 烷基或 C_{1-3} 卤代烷基取代)或 C_{1-6} 烷氧基; R^2, R^3, R^9 和 R^{10} 全部是氢; R^4 是氟, 氯, 溴, C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 卤代烷基; n 是 1 或 2 和 R^8 是苯基 CH_2- (其中该苯基任选被卤素, C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 卤代烷基, C_{1-4} 卤代烷氧基, CN, NO_2 , 芳基, 杂芳基, 氨基或二烷基氨基取代), 杂芳基 CH_2- (其中该杂芳基是任选被卤素, 硝基, 氰基, C_{1-6} 烷基, C_{1-6} 卤代烷基, C_{1-6} 烷氧基或 C_{1-6} 卤代烷氧基取代的双环基团), 或 $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$, 其中 z 是 1 或 2, R^{51} 和 R^{52} 各自独立地是 H, 卤素或 C_{1-2} 烷基, R^{53} 和 R^{54} 各自独立地是 H, 卤素, C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 卤代烷基和 R^{55} 是任选被取代的芳基或任选被取代的杂芳基, 前提条件是, a) 当 R^4 是 5-氟和 R^1 是 2, 6-二氟吡啶-4-基时, 则 R^8 不是 4-甲基苄基, 3-甲基苄基, 4-三氟甲氧基苄基, 4-三氟甲基苄基, 4-氰基苄基, 4-甲基羰基苄基或肉桂基和 b) 当 R^4 是 5-氟和 R^1 是 2-氟吡啶-4-基时, 则 R^8 不是 3-氟苄基, 3, 5-二氟苄基, 4-三氟甲氧基苄基, 4-三氟甲基苄基, 4-氰基苄基或 4-甲基羰基苄基。

下列表 I 到 XXXII 的化合物举例说明本发明的化合物。

表 I 提供了结构式 Ia 的 301 种化合物



其中 $R^8, R^{4a}, R^{4b}, R^{4c}$ 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出

表 1

化合物	R ^b	R ⁴ _a	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	Cl	H	H	H
I-13	4-氟肉桂基	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	2,4-二氟肉桂基	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-氟肉桂基	H	Cl	H	H
I-23	4-氟肉桂基	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	2,4-二氟肉桂基	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-氟肉桂基	H	H	Cl	H
I-33	4-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	H	Cl	Cl	H
I-173	4-氟肉桂基	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	2,4-二氟肉桂基	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-氟肉桂基	H	I	H	H
I-183	4-氟肉桂基	H	I	H	H
I-184	4-硝基肉桂基	H	I	H	H

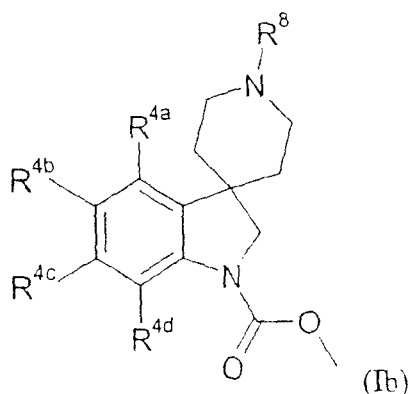
I-185	4-甲氧基肉桂基	H	I	H	H
I-186	4-甲基肉桂基	H	I	H	H
I-187	4-三氟甲基肉桂基	H	I	H	H
I-188	4-氟基肉桂基	H	I	H	H
I-189	2,4-二氟肉桂基	H	I	H	H
I-190	2,4-二氟肉桂基	H	I	H	H
I-191	肉桂基	H	OMe	H	H
I-192	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H
I-193	4-氟肉桂基	H	OMe	H	H
I-194	4-硝基肉桂基	H	OMe	H	H
I-195	4-甲氧基肉桂基	H	OMe	H	H
I-196	4-甲基肉桂基	H	OMe	H	H
I-197	4-三氟甲基肉桂基	H	OMe	H	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	H	Me	Cl	H
I-243	4-氟肉桂基	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

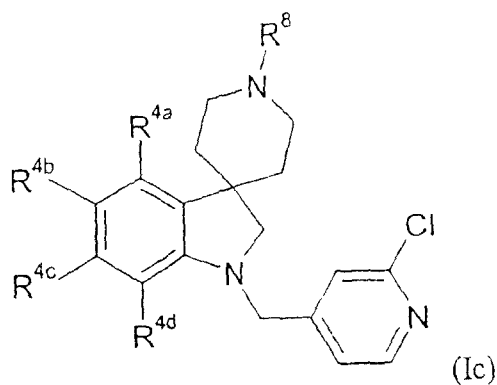
I-247	4-三氟甲基肉桂基	H	Me	Cl	H
I-248	4-氟基肉桂基	H	Me	Cl	H
I-249	2,4-二氟肉桂基	H	Me	Cl	H
I-250	2,4-二氟肉桂基	H	Me	Cl	H
I-251	肉桂基	Cl	Me	H	H
I-252	4-氟肉桂基	Cl	Me	H	H
I-253	4-氟肉桂基	Cl	Me	H	H
I-254	4-硝基肉桂基	Cl	Me	H	H
I-255	4-甲氧基肉桂基	Cl	Me	H	H
I-256	4-甲基肉桂基	Cl	Me	H	H
I-257	4-三氟甲基肉桂基	Cl	Me	H	H
I-258	4-氟基肉桂基	Cl	Me	H	H
I-259	2,4-二氟肉桂基	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-氟肉桂基	H	Cl	H	Me
I-263	4-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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

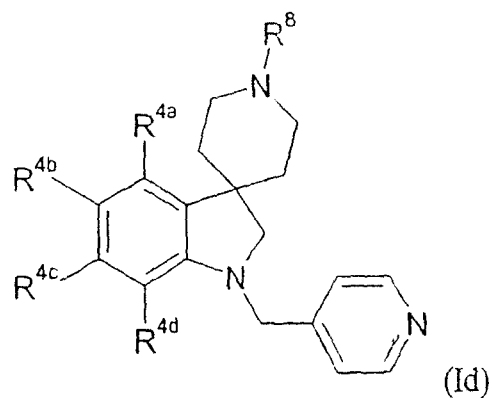
表 II 提供了结构式 Ib 的 301 种化合物



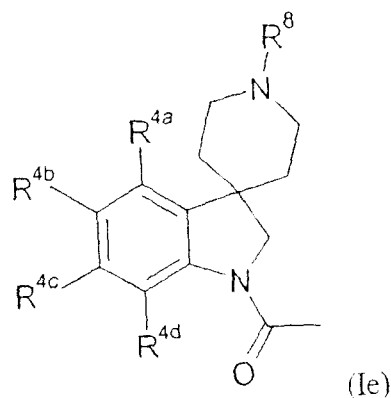
其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 III 提供了结构式 Ic 的 301 种化合物



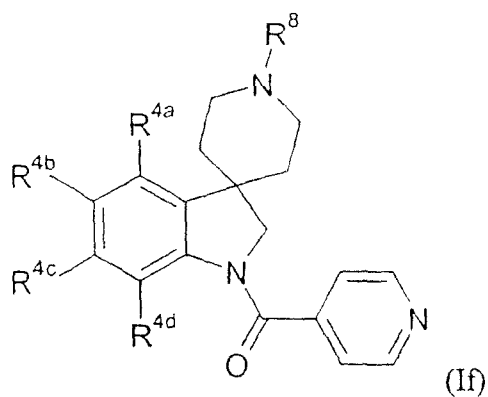
其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 IV 提供了结构式 Id 的 301 种化合物



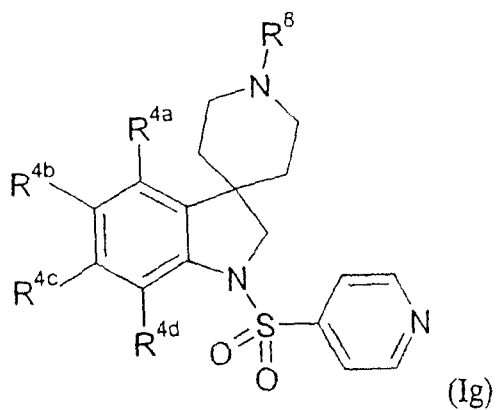
其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 V 提供了结构式 Ie 的 301 种化合物



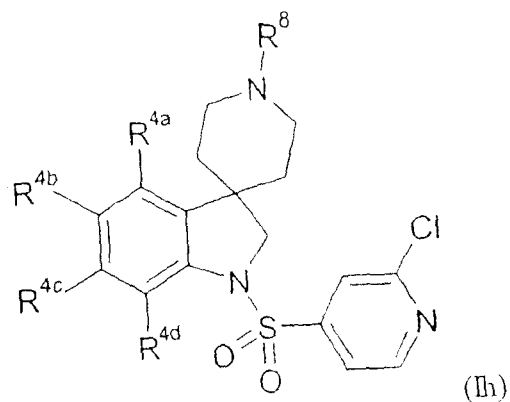
其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 VI 提供了结构式 If 的 301 种化合物



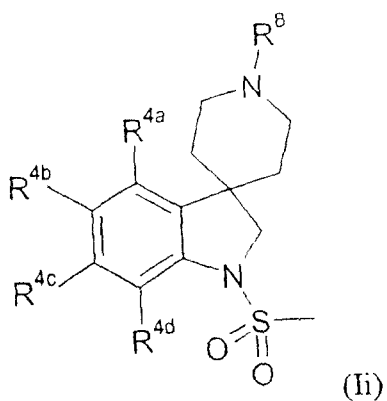
其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 VII 提供了结构式 Ig 的 301 种化合物



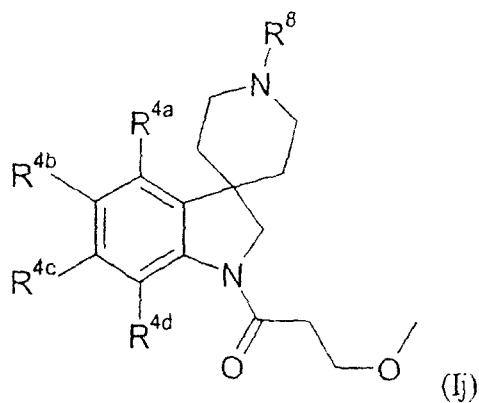
其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 VIII 提供了结构式 Ih 的 301 种化合物



其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 IX 提供了结构式 Ii 的 301 种化合物

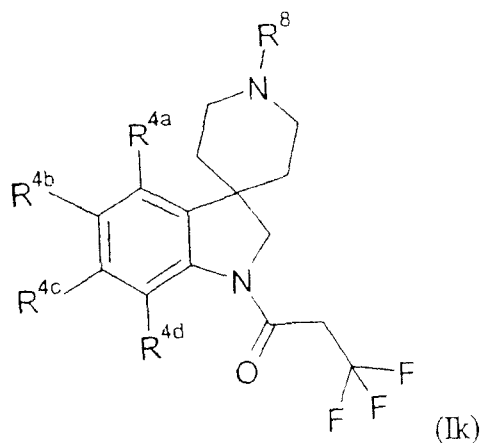


其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 X 提供了结构式 Ij 的 301 种化合物

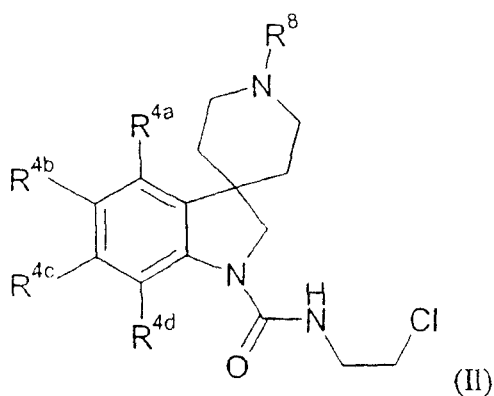


其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出

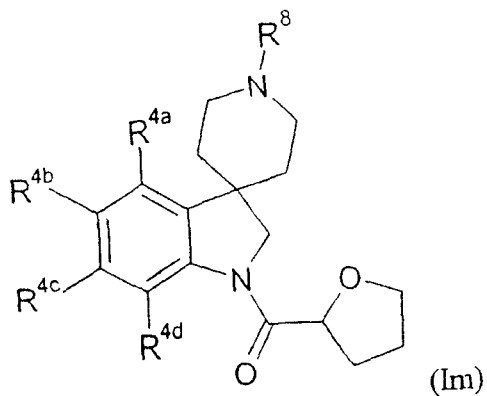
表 XI 提供了结构式 Ik 的 301 种化合物



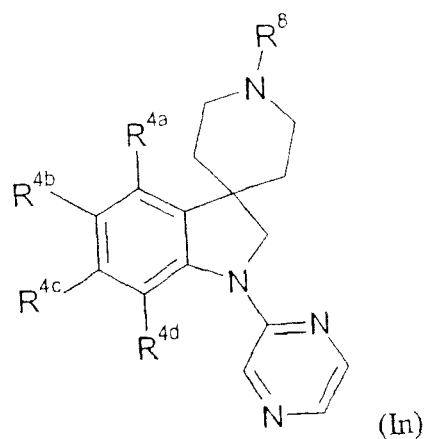
其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 XII 提供了结构式 II 的 301 种化合物



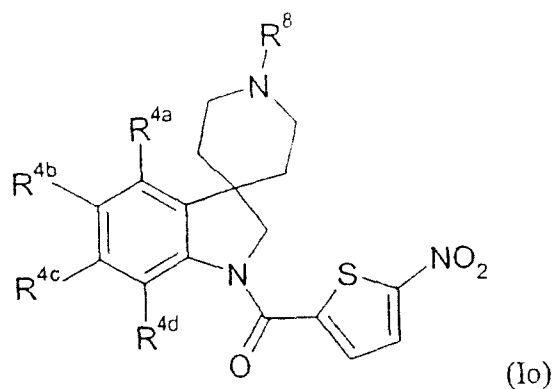
其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 XIII 提供了结构式 Im 的 301 种化合物



其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 XIV 提供了结构式 In 的 301 种化合物

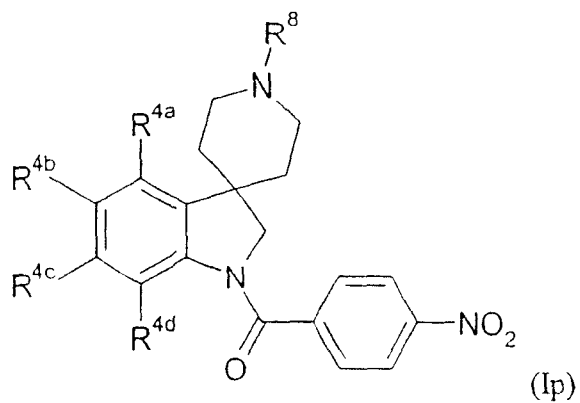


其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 XV 提供了结构式 Io 的 301 种化合物

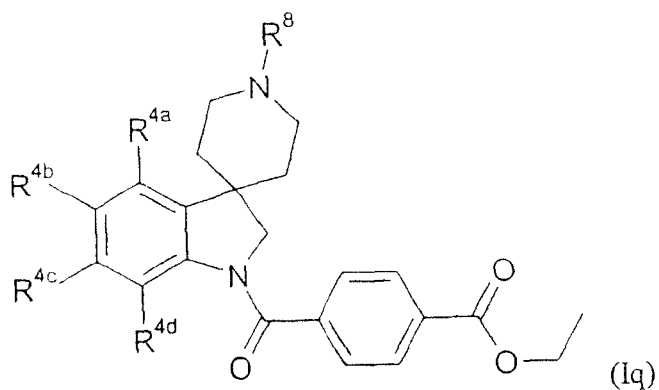


其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出

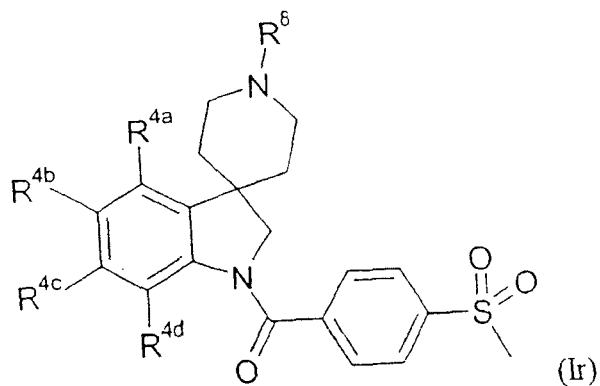
表 XVI 提供了结构式 Ip 的 301 种化合物



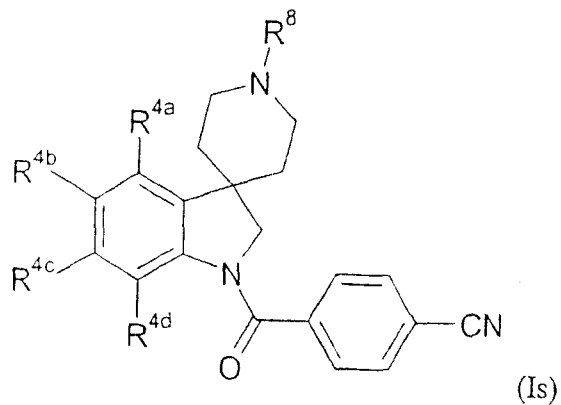
其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 XVII 提供了结构式 Iq 的 301 种化合物



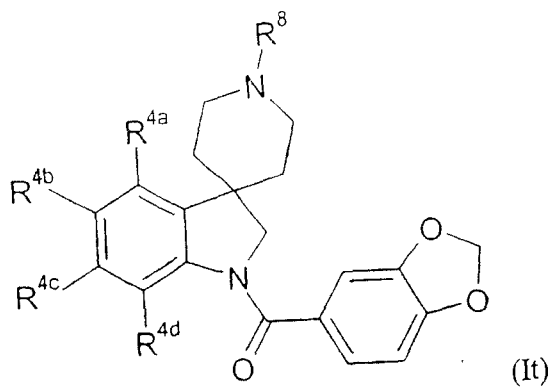
其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 XVIII 提供了结构式 Ir 的 301 种化合物



其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 XIX 提供了结构式 Is 的 301 种化合物

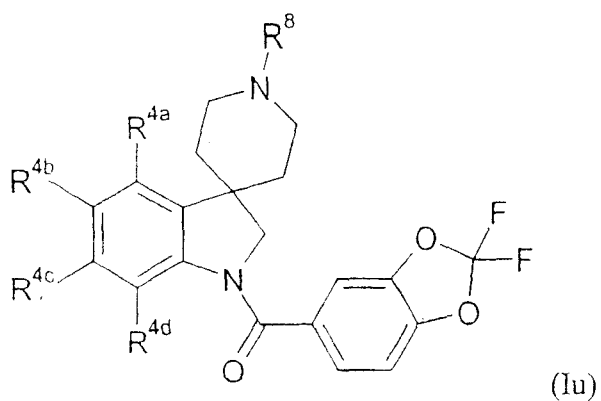


其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 XX 提供了结构式 It 的 301 种化合物

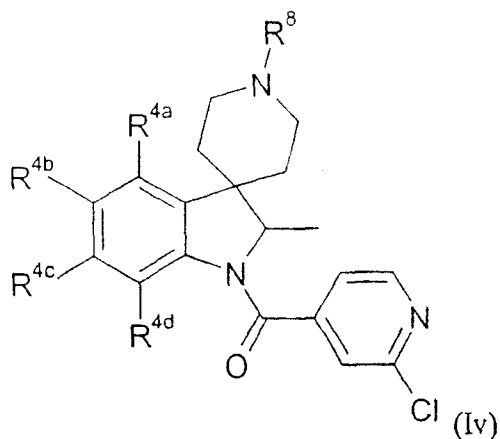


其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出

表 XXI 提供了结构式 Iu 的 301 种化合物

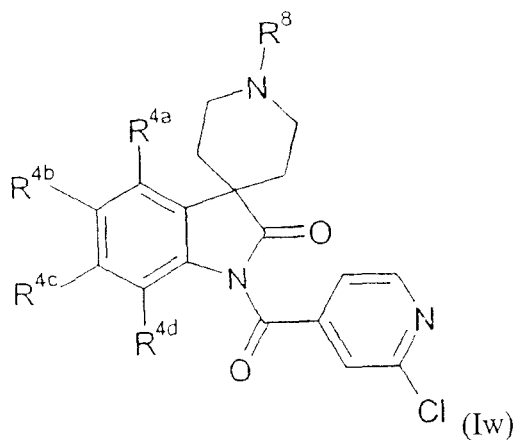


其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 XXII 提供了结构式 Iv 的 301 种化合物

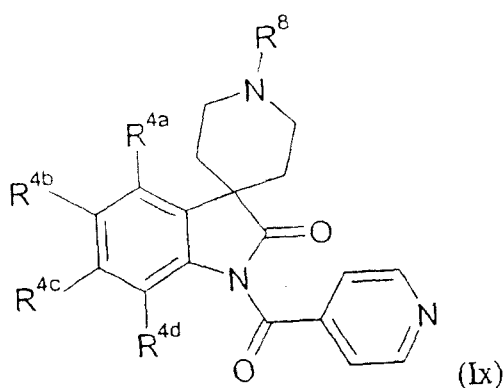


其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出

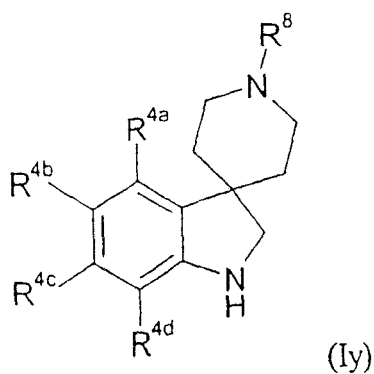
表 XXIII 提供了结构式 Iw 的 301 种化合物



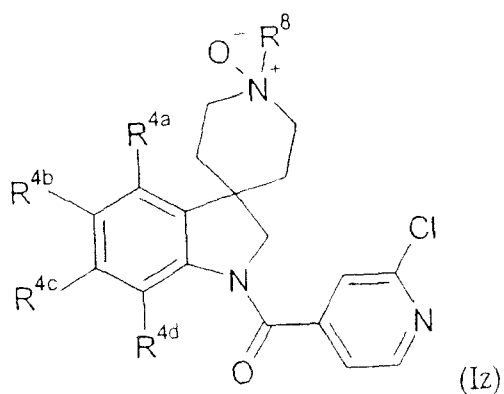
其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 XXIV 提供了结构式 Ix 的 301 种化合物



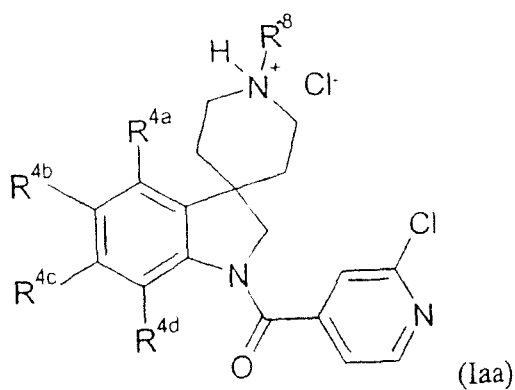
其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 XXV 提供了结构式 Iy 的 301 种化合物



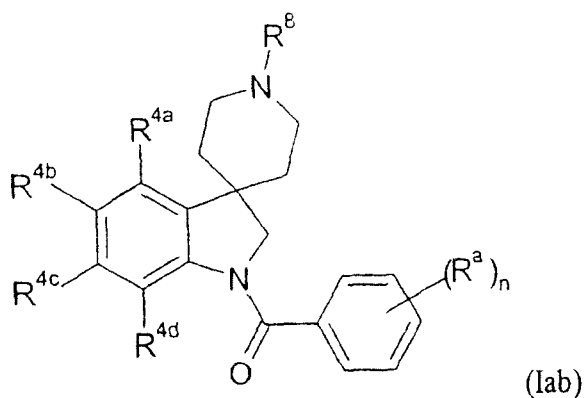
其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 XXVI 提供了结构式 Iz 的 301 种化合物



其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 XXVII 提供了结构式 Iaa 的 301 种化合物



其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} 和 R^{4d} 的值在表 1 中给出
表 XXVIII 提供了结构式 Iab 的 270 种化合物



其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , R^{4c} , R^{4d} 和 $(R^a)_n$ 的值在表 2 中给出

表 2

化合物	R ⁸	R ⁴ _a	R ^{4b}	R ⁴ _c	R ^{4d}	(R ^a) _n
XXVIII-1	肉桂基	H	H	H	H	4-SMe
XXVIII-2	4-氟肉桂基	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-氟基肉桂基	H	H	H	H	4-SMe
XXVIII-6	肉桂基	H	Cl	H	H	4-SMe
XXVIII-7	4-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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

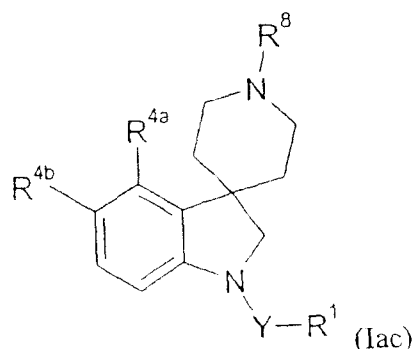
XXVIII-89	4-三氟甲基肉桂基	H	OMe	H	H	4-F
XXVIII-90	4-氟基肉桂基	H	OMe	H	H	4-F
XXVIII-91	肉桂基	H	H	H	H	3-CN
XXVIII-92	4-氟肉桂基	H	H	H	H	3-CN
XXVIII-93	4-氟肉桂基	H	H	H	H	3-CN
XXVIII-94	4-三氟甲基肉桂基	H	H	H	H	3-CN
XXVIII-95	4-氟基肉桂基	H	H	H	H	3-CN
XXVIII-96	肉桂基	H	Cl	H	H	3-CN
XXVIII-97	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	3-CN
XXVIII-98	4-氟肉桂基	H	Cl	H	H	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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-氟肉桂基	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 提供了结构式 Iac 的 214 种化合物



其中 R^8 , R^{4a} , R^{4b} , Y 和 R^1 的值在表 3 中给出

表 3

	R^8	R^{4a}	R^{4b}	Y	R^1
XXIX-1	2-(苯并噁唑基)甲基	H	C1	C(0)	2-氟吡啶-4-基
XXIX-2	2-(苯并噁唑基)甲基	H	F	C(0)	2-氟吡啶-4-基
XXIX-3	2-(苯并噁唑基)甲基	H	C1	键	甲氧羰基
XXIX-4	2-(苯并噁唑基)甲基	H	F	键	甲氧羰基
XXIX-5	2-(苯并噁唑基)甲基	H	C1	键	乙酰基
XXIX-6	2-(苯并噁唑基)甲基	H	F	键	乙酰基
XXIX-7	2-甲基-3-(3',4'-亚甲基二 氧基苯基)丙-2-烯基	H	C1	C(0)	2-氟吡啶-4-基
XXIX-8	2-甲基-3-(3',4'-亚甲基二 氧基苯基)丙-2-烯基	H	F	C(0)	2-氟吡啶-4-基
XXIX-9	2-甲基-3-(3',4'-亚甲基二 氧基苯基)丙-2-烯基	H	C1	键	甲氧羰基
XXIX-10	2-甲基-3-(3',4'-亚甲基二 氧基苯基)丙-2-烯基	H	F	键	甲氧羰基

XXIX-11	2-甲基-3-(3',4'-亚甲基二氧基苯基)丙-2-烯基	H	C1	键	乙酰基
XXIX-12	2-甲基-3-(3',4'-亚甲基二氧基苯基)丙-2-烯基	H	F	键	乙酰基
XXIX-13	3-苯基丙-2-炔基	H	C1	C(0)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-14	3-苯基丙-2-炔基	H	F	C(0)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-15	3-苯基丙-2-炔基	H	C1	键	甲氧羰基
XXIX-16	3-苯基丙-2-炔基	H	F	键	甲氧羰基
XXIX-17	3-苯基丙-2-炔基	H	C1	键	乙酰基
XXIX-18	3-苯基丙-2-炔基	H	F	键	乙酰基
XXIX-19	三氟乙酰胺基	H	C1	C(0)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-20	三氟乙酰胺基	H	F	C(0)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-21	三氟乙酰胺基	H	C1	键	甲氧羰基
XXIX-22	三氟乙酰胺基	H	F	键	甲氧羰基
XXIX-23	三氟乙酰胺基	H	C1	键	乙酰基
XXIX-24	三氟乙酰胺基	H	F	键	乙酰基
XXIX-25	4-氯肉桂酸酯	H	C1	C(0)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-26	4-氯肉桂酸酯	H	F	C(0)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-27	4-氯肉桂酸酯	H	C1	键	甲氧羰基
XXIX-28	4-氯肉桂酸酯	H	F	键	甲氧羰基
XXIX-29	4-氯肉桂酸酯	H	C1	键	乙酰基
XXIX-30	4-氯肉桂酸酯	H	F	键	乙酰基
XXIX-31	2-氧代-2-(2'-氯-4'-甲基苯基)乙基	H	C1	C(0)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-32	2-氧代-2-(2'-氯-4'-甲基苯基)乙基	H	F	C(0)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-33	2-氧代-2-(2'-氯-4'-甲基苯基)乙基	H	C1	键	甲氧羰基
XXIX-34	2-氧代-2-(2'-氯-4'-甲基苯基)乙基	H	F	键	甲氧羰基
XXIX-35	2-氧代-2-(2'-氯-4'-甲基苯基)乙基	H	C1	键	乙酰基
XXIX-36	2-氧代-2-(2'-氯-4'-甲基苯基)乙基	H	F	键	乙酰基
XXIX-37	2-氧代-1,2-二苯基乙基	H	C1	C(0)	2-氯吡啶-4-基

XXIX-38	2-氧代-1,2-二苯基乙基	H	F	C(0)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-39	2-氧代-1,2-二苯基乙基	H	C1	键	甲氧羰基
XXIX-40	2-氧代-1,2-二苯基乙基	H	F	键	甲氧羰基
XXIX-41	2-氧代-1,2-二苯基乙基	H	C1	键	乙酰基
XXIX-42	2-氧代-1,2-二苯基乙基	H	F	键	乙酰基
XXIX-43	3,3-二氯烯丙基	H	C1	C(0)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-44	3,3-二氯烯丙基	H	F	C(0)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-45	3,3-二氯烯丙基	H	C1	键	甲氧羰基
XXIX-46	3,3-二氯烯丙基	H	F	键	甲氧羰基
XXIX-47	3,3-二氯烯丙基	H	C1	键	乙酰基
XXIX-48	3,3-二氯烯丙基	H	F	键	乙酰基
XXIX-49	叔丁基氧基羰基	H	F	键	H
XXIX-50	叔丁基氧基羰基	H	C1	键	H
XXIX-51	叔丁基氧基羰基	H	C1	C(0)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-52	叔丁基氧基羰基	H	F	C(0)	2-氯吡啶-4-基
XXIX-53	叔丁基氧基羰基	H	C1	键	甲氧羰基
XXIX-54	叔丁基氧基羰基	H	F	键	甲氧羰基
XXIX-55	叔丁基氧基羰基	H	C1	键	乙酰基
XXIX-56	叔丁基氧基羰基	H	F	键	乙酰基
XXIX-57	4-氟肉桂基	H	C1	键	5-三氟甲基吡啶-2-基
XXIX-58	4-氟肉桂基	H	F	键	5-三氟甲基吡啶-2-基
XXIX-59	4-氟肉桂基	Br	H	键	5-三氟甲基吡啶-2-基
XXIX-60	4-氟肉桂基	H	C1	键	5-三氟甲基吡啶-2-基
XXIX-61	4-氟肉桂基	H	F	键	5-三氟甲基吡啶-2-基
XXIX-62	4-氟肉桂基	Br	H	键	5-三氟甲基吡啶-2-基
XXIX-63	4-氟肉桂基	H	C1	键	嘧啶-2-基
XXIX-64	4-氟肉桂基	H	F	键	嘧啶-2-基
XXIX-65	4-氟肉桂基	Br	H	键	嘧啶-2-基
XXIX-66	4-氟肉桂基	H	C1	键	嘧啶-2-基
XXIX-67	4-氟肉桂基	H	F	键	嘧啶-2-基
XXIX-68	4-氟肉桂基	Br	H	键	嘧啶-2-基
XXIX-69	4-氟肉桂基	H	C1	C(0)	吡嗪基
XXIX-70	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	吡嗪基
XXIX-71	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	吡嗪基
XXIX-72	4-氟肉桂基	H	C1	C(0)	吡嗪基

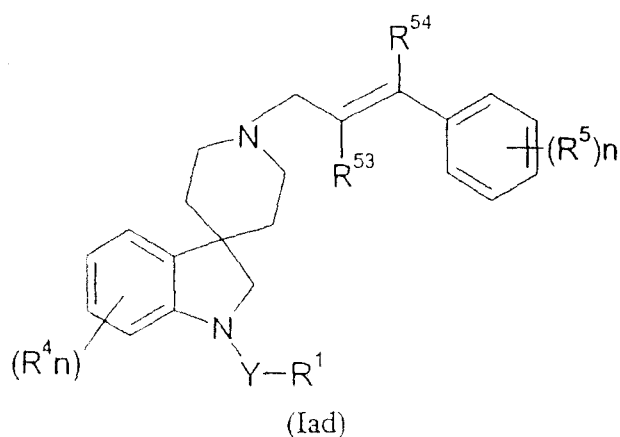
XXIX-73	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	吡嗪基
XXIX-74	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	吡嗪基
XXIX-75	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	2-氟吡啶-5-基
XXIX-76	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	2-氟吡啶-5-基
XXIX-77	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	2-氟吡啶-5-基
XXIX-78	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	2-氟吡啶-5-基
XXIX-79	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	2-氟吡啶-5-基
XXIX-80	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	2-氟吡啶-5-基
XXIX-81	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	1, 2, 3-噁二唑-4-基
XXIX-82	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	1, 2, 3-噁二唑-4-基
XXIX-83	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	1, 2, 3-噁二唑-4-基
XXIX-84	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	1, 2, 3-噁二唑-4-基
XXIX-85	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	1, 2, 3-噁二唑-4-基
XXIX-86	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	1, 2, 3-噁二唑-4-基
XXIX-87	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	1-甲基-5-硝基-[1H]-吡啶-4-基
XXIX-88	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	1-甲基-5-硝基-[1H]-吡啶-4-基
XXIX-89	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	1-甲基-5-硝基-[1H]-吡啶-4-基
XXIX-90	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	1-甲基-5-硝基-[1H]-吡啶-4-基
XXIX-91	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	1-甲基-5-硝基-[1H]-吡啶-4-基
XXIX-92	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	1-甲基-5-硝基-[1H]-吡啶-4-基
XXIX-93	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	5-甲氧羰基吡啶-2-基
XXIX-94	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	5-甲氧羰基吡啶-2-基
XXIX-95	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	5-甲氧羰基吡啶-2-基
XXIX-96	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	5-甲氧羰基吡啶-2-基
XXIX-97	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	5-甲氧羰基吡啶-2-基
XXIX-98	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	5-甲氧羰基吡啶-2-基
XXIX-99	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	4-氟吡啶-2-基
XXIX-100	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	4-氟吡啶-2-基
XXIX-101	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	4-氟吡啶-2-基
XXIX-102	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	4-氟吡啶-2-基
XXIX-103	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	4-氟吡啶-2-基
XXIX-104	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	4-氟吡啶-2-基
XXIX-105	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	2-甲基-6-三氟甲基吡啶-3-基

XXIX-106	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	2-甲基-6-三氟甲基吡啶-3-基
XXIX-107	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	2-甲基-6-三氟甲基吡啶-3-基
XXIX-108	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	2-甲基-6-三氟甲基吡啶-3-基
XXIX-109	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	2-甲基-6-三氟甲基吡啶-3-基
XXIX-110	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	2-甲基-6-三氟甲基吡啶-3-基
XXIX-111	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	5-甲基异噁唑-3-基
XXIX-112	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	5-甲基异噁唑-3-基
XXIX-113	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	5-甲基异噁唑-3-基
XXIX-114	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	5-甲基异噁唑-3-基
XXIX-115	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	5-甲基异噁唑-3-基
XXIX-116	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	5-甲基异噁唑-3-基
XXIX-117	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	(吡啶-4-基)甲基
XXIX-118	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	(吡啶-4-基)甲基
XXIX-119	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	(吡啶-4-基)甲基
XXIX-120	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	(吡啶-4-基)甲基
XXIX-121	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	(吡啶-4-基)甲基
XXIX-122	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	(吡啶-4-基)甲基
XXIX-123	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	(噁吩-2-基)甲基
XXIX-124	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	(噁吩-2-基)甲基
XXIX-125	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	(噁吩-2-基)甲基
XXIX-126	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	(噁吩-2-基)甲基
XXIX-127	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	(噁吩-2-基)甲基
XXIX-128	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	(噁吩-2-基)甲基
XXIX-129	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	环戊基
XXIX-130	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	环戊基
XXIX-131	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	环戊基
XXIX-132	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	环戊基
XXIX-133	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	环戊基
XXIX-134	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	环戊基
XXIX-135	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	乙酰胺基甲基
XXIX-136	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	乙酰胺基甲基
XXIX-137	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	乙酰胺基甲基
XXIX-138	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	乙酰胺基甲基
XXIX-139	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	乙酰胺基甲基
XXIX-140	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	乙酰胺基甲基
XXIX-141	4-氟肉桂基	H	Cl	SO ₂	4-乙酰基氨基苯基
XXIX-142	4-氟肉桂基	H	F	SO ₂	4-乙酰基氨基苯基
XXIX-143	4-氟肉桂基	Br	H	SO ₂	4-乙酰基氨基苯基
XXIX-144	4-氟肉桂基	H	Cl	SO ₂	4-乙酰基氨基苯基
XXIX-145	4-氟肉桂基	H	F	SO ₂	4-乙酰基氨基苯基

XXIX-146	4-氟肉桂基	Br	H	SO ₂	4-乙酰基氨基苯基
XXIX-147	4-氟肉桂基	H	Cl	SO ₂	3,5-二甲基异噁唑-4-基
XXIX-148	4-氟肉桂基	H	F	SO ₂	3,5-二甲基异噁唑-4-基
XXIX-149	4-氟肉桂基	Br	H	SO ₂	3,5-二甲基异噁唑-4-基
XXIX-150	4-氟肉桂基	H	Cl	SO ₂	3,5-二甲基异噁唑-4-基
XXIX-151	4-氟肉桂基	H	F	SO ₂	3,5-二甲基异噁唑-4-基
XXIX-152	4-氟肉桂基	Br	H	SO ₂	3,5-二甲基异噁唑-4-基
XXIX-153	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	(2-甲氧基苯基)氨基
XXIX-154	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	(2-甲氧基苯基)氨基
XXIX-155	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	(2-甲氧基苯基)氨基
XXIX-156	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	(2-甲氧基苯基)氨基
XXIX-157	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	(2-甲氧基苯基)氨基
XXIX-158	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	(2-甲氧基苯基)氨基
XXIX-159	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	环己烯-1-基
XXIX-160	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	环己烯-1-基
XXIX-161	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	环己烯-1-基
XXIX-162	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	环己烯-1-基
XXIX-163	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	环己烯-1-基
XXIX-164	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	环己烯-1-基
XXIX-165	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	喹啉-3-基
XXIX-166	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	喹啉-3-基
XXIX-167	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	喹啉-3-基
XXIX-168	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	喹啉-3-基
XXIX-169	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	喹啉-3-基
XXIX-170	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	喹啉-3-基
XXIX-171	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	苯并噁吩-2-基
XXIX-172	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	苯并噁吩-2-基
XXIX-173	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	苯并噁吩-2-基
XXIX-174	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	苯并噁吩-2-基
XXIX-175	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	苯并噁吩-2-基
XXIX-176	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	苯并噁吩-2-基
XXIX-177	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	5-硝基-[1H]-吡唑-3-基
XXIX-178	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	5-硝基-[1H]-吡唑-3-基
XXIX-179	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	5-硝基-[1H]-吡唑-3-基
XXIX-180	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	5-硝基-[1H]-吡唑-3-基
XXIX-181	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	5-硝基-[1H]-吡唑-3-基
XXIX-182	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	5-硝基-[1H]-吡唑-3-基

XXIX-183	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	([1H]-四唑-1-基)甲基
XXIX-184	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	([1H]-四唑-1-基)甲基
XXIX-185	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	([1H]-四唑-1-基)甲基
XXIX-186	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	([1H]-四唑-1-基)甲基
XXIX-187	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	([1H]-四唑-1-基)甲基
XXIX-188	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	([1H]-四唑-1-基)甲基
XXIX-189	4-氟肉桂基	H	Cl	键	苄基
XXIX-190	4-氟肉桂基	H	F	键	苄基
XXIX-191	4-氟肉桂基	Br	H	键	苄基
XXIX-192	4-氟肉桂基	H	Cl	键	苄基
XXIX-193	4-氟肉桂基	H	F	键	苄基
XXIX-194	4-氟肉桂基	Br	H	键	苄基
XXIX-195	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	(4-氟基苯基)氨基
XXIX-196	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	(4-氟基苯基)氨基
XXIX-197	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	(4-氟基苯基)氨基
XXIX-198	4-氟肉桂基	H	Cl	C(0)	(4-氟基苯基)氨基
XXIX-199	4-氟肉桂基	H	F	C(0)	(4-氟基苯基)氨基
XXIX-200	4-氟肉桂基	Br	H	C(0)	(4-氟基苯基)氨基
XXIX-201	4-氟肉桂基	H	Me ₃ SiCC	C(0)	2-氟吡啶-4-基
XXIX-202	4-氟肉桂基	H	Me ₃ SiCC	C(0)	2-氟吡啶-4-基
XXIX-203	4-氟肉桂基	H	Me ₃ SiCC	键	甲氧羰基
XXIX-204	4-氟肉桂基	H	Me ₃ SiCC	键	甲氧羰基
XXIX-205	4-氟肉桂基	H	Me ₃ SiCC	键	乙酰基
XXIX-206	4-氟肉桂基	H	Me ₃ SiCC	键	乙酰基
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 提供结构式 Iad 的 121 种化合物



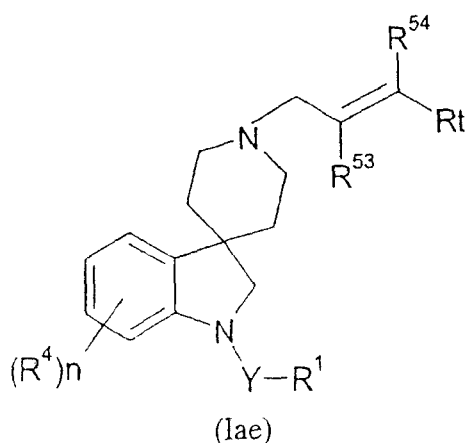
	R ⁴ _n	R ⁵³	R ⁵⁴	R ⁵ _n	Y	R ¹
XXX-1	6-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-2	6-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-3	4-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-4	6-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-5	4-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	Me
XXX-6	4-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-7	6-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-8	4-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-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-氯吡啶-4-基
XXX-11	5-OCH ₂ CH ₃	H	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-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)	2,6-二氯吡啶-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)	2,6-二氯吡啶-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)	2,6-二氯吡啶-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)	3,5-二氯吡啶-4-基
XXX-23	4-OCF ₃	H	H	4-Cl	C(O)	4,6-二甲氧基-嘧啶-2-基
XXX-24	4-OCF ₂ CHF ₂	H	H	4-Cl	C(O)	4,6-二甲氧基-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-4-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-异丙基	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-4-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-叔丁基	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)	2-氯吡啶-4-基
XXX-83	5-Cl	H	Me	4-Cl	C(O)	Me
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)	Me
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-1-基
XXX-94	5-F	H	H	4-Cl	键	NH ₂
XXX-95	5-F	H	H	4-Cl	键	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	键	NHCO-4-三氟甲氧基-苯基
XXX-98	5-Cl	H	H	4-Cl	键	-NHCO-吡啶-4-基

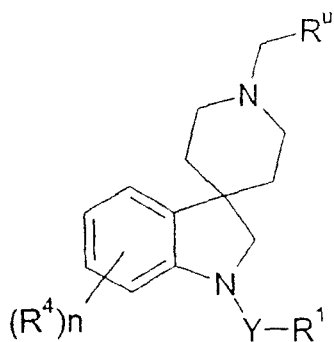
XXX-99	5-Cl	H	H	4-Cl	键	-NHCO- 3-氯吡啶-4-基
XXX-100	5-F	H	H	4-Cl	键	-NHCONH-4- 三氟甲氧基-苯基
XXX-101	5-F	H	H	4-Cl	键	-NHCONH-3- 氯苯基
XXX-102	5-Cl	H	H	4-Cl	键	-N=C(Me)NMe ₂
XXX-103	5-Cl	H	H	4-Cl	键	-NHCONH-4- 三氟甲基-苯基
XXX-104	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH-异丙基
XXX-105	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-NH(CH ₂) ₂ OMe
XXX-106	5-F	H	H	4-Cl	C(O)	-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 - 吗啉基
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-苄基
XXX-113	5-Cl	F	H	4-Cl	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXX-114	5-Cl	F	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	键	-NHCONH-4- 氯苯基
XXX-120	5-F	H	H	4-Cl	键	乙基
XXX-121	5-Cl	H	H	4-Cl	键	NO

表 XXXI 提供结构式 Iae 的 8 种化合物



	R ⁿ	R ⁵³	R ⁵⁴	R _t	Y	R ¹
XXXI-1	5-C1	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-C1	H	H	噻吩-2-基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXI-4	5-C1	H	H	萘-2-基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXI-5	5-C1	H	H	-CH=CH-苯基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXI-6	5-C1	H	H	苯并噻吩-2-基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXI-7	5-C1	H	H	-CH=CH-4-氯苯基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXI-8	5-C1	H	H	Br	C(O)	2-氯吡啶-4-基

表 XXXII 提供结构式 Iaf 的 10 种化合物



(Iaf)

	R ⁿ	R _u	Y	R ¹
XXXII-1	5-C1	4-F-Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-2	5-C1	4-OCF ₃ -Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-3	5-C1	4-C1-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-C1	-CH(OH)CH ₂ O-4-C1-Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-6	5-C1	-C(Me)=NO-Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-7	5-C1	5-C1-苯并噁唑-2-基	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-8	5-C1	4-NHCOOCH(Me) ₂ -Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-9	5-C1	4-NHCOOCH(Me) ₂ -Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基
XXXII-10	5-C1	(2-乙基-四唑-5-基)-4-Ph	C(O)	2-氯吡啶-4-基

对于表 I 到 XXIX 的所选择化合物在 Micromass Platform 2 机器上获得了质谱数据。数据示于表 3 中。

化合物号	MS 数据
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-195	501 (100%), 503 (40%)	XXIX-207	489 (100%), 491 (40%)
XXIX-183	467 (100%), 469 (35%)	XXIX-196	517 (100%), 519 (70%), 521 (15%)		
XXIX-189	463 (100%), 465 (55%), 467 (15%)	XXIX-201	574 (100%), 576 (80%), 578 (20%)		

对于表 XXX 到 XXXII 的所选择化合物获得质谱数据，其中使用 LCMS: LC5: 254nm-梯度 10% A 到 100% B A = H₂O + 0.01% HCOOH B = CH₃CN/CH₃OH + 0.01% HCOOH 正性电喷雾 150-1000 m/z 数据示于表 4 中。

表 4

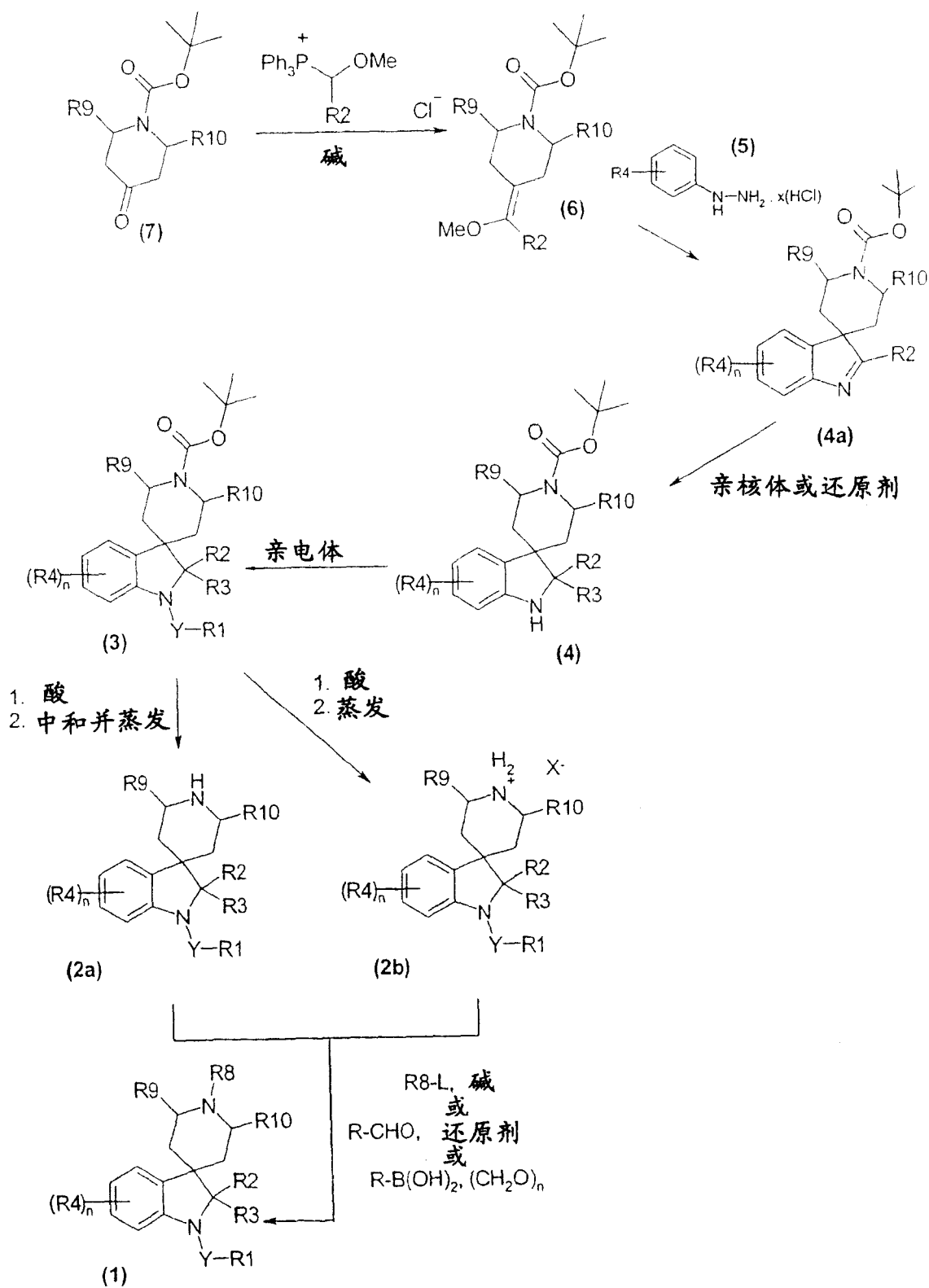
化合物	mp (°C)	LCMS(Ret. 时间, min)	LCMS (M+H)
XXX-1		2'27	465
XXX-2		2'55	562
XXX-3		2'26	465
XXX-4		2'30	497
XXX-5		2'30	497
XXX-6		2'48	562
XXX-7		2'48	594
XXX-8		2'51	594
XXX-9		2'28	473
XXX-10		2'43	570
XXX-11		2'26	522
XXX-12		2'57	686
XXX-13		2'56	596
XXX-14		2'09	528
XXX-15		2'60	718
XXX-16		2'71	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
XXX1-1			547
XXXI-2	147-148		
XXXI-3			484
XXX1-4			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

本发明的化合物能够以各种方式制备。例如它们可以通过反应历程 I 中概括的反应来制备。

反应历程 I



因此结构式 1 的化合物可以由结构式 2a 或 2b 的化合物与结构式 R^8-L 的烷基化剂, 其中 L 是氯、溴、碘或磺酸根(例如甲磺酸根或甲苯磺酸根)或类似的离去基团, 在环境温度和 100°C 之间的温度下, 典型地 65°C 下, 在有机溶剂如二氯甲烷、氯仿或 1, 2-二氯乙烷中在叔胺碱如三乙胺或二异丙基乙胺存在下的和任选被由卤化物盐如碘化钠、碘化钾或碘化四丁铵催化的反应来合成。

另外地, 结构式 2a 或 2b 的化合可以与结构式 RCHO 的醛在环境温度和 100°C 之间的温度下在有机溶剂如四氢呋喃或乙醇或该溶剂的混合物中, 在还原剂如硼烷-吡啶配合物, 硼氢化钠, (三乙酰氧基)氢硼化钠, 氰基硼氢化钠或类似物存在下进行反应, 来制备其中 R^8 是 CH_2-R 的结构式 1 的化合物。

另外地, 结构式 2a 或 2b 的化合物可以与仲甲醛和结构式 R-B(OH)_2 的硼酸在环境温度和 100°C 之间的温度下在有机溶剂如乙醇、1, 4-二噁烷或水中进行反应, 来制备其中 R^8 是 CH_2-R 的结构式 1 的化合物。

结构式 2a 的化合物可以由结构式 3 的化合物与酸如三氟乙酸在环境温度中在有机溶剂如二氯甲烷、氯仿或 1, 2-二氯乙烷中反应, 随后该反应混合物用无机碱如碳酸钠、碳酸氢钠或类似化合物的水溶液中和来获得。

类似地, 结构式 2b 的化合物可以由结构式 3 的化合物与酸如三氟乙酸在环境温度下在有机溶剂如二氯甲烷、氯仿或 1, 2-二氯乙烷中反应, 随后蒸发溶剂和用有机溶剂如醚类或己烷研制来线虫。

结构式 3 的化合物可以由结构式 4 的化合物与合适的吸电子物质反应来获得。其中 Y 是羰基的结构式 3 的化合物可以由结构式 4 的化合物与结构式 $\text{R}^1-\text{C(O)}-\text{Z}$ 的羧酸衍生物, 其中 Z 是氯、羟基、烷氧基或酰氧基, 在 0°C 和 150°C 之间的温度下, 任选在有机溶剂如二氯甲烷、氯仿或 1, 2-二氯乙烷中, 任选在叔胺碱如三乙胺或二异丙基乙胺和任选在偶联剂如二环己基碳二亚胺存在下进行反应来形成。其中 Y 是羰基和 R^1 是结构式 $\text{R}'-\text{NH}-$ 的氨基取代基的结构式 3 的化合物可以由结构式 4 的化合物与结构式 $\text{R}'-\text{N}=\text{C}=\text{O}$ 的异氰酸酯在类似条件下反应来形

成。其中 Y 是结构式 $S(O)_q$ 的基团的结构式 3 的化合物可以在类似条件下用结构式 $R^1-S(O)_q-Cl$ 的化合物处理结构式 4 的化合物来形成。其中 Y 是硫代羰基和 R^1 是结构式 $R'-NH-$ 的氨基取代基的结构式 3 的化合物可以由结构式 3 的化合物与结构式 $R'-N=C=S$ 的异硫氰酸酯在类似条件下反应来形成。另外地，其中 Y 是硫代羰基和 R^1 是碳取代基的结构式 3 的化合物可以通过用合适的硫化试剂如 Lawesson 试剂处理其中 Y 是羰基和 R^1 是碳取代基的结构式 3 的化合物来形成。

在上述程序中，结构式 $R^1-C(O)-Z$ 的酸衍生物，结构式 $R'-N=C=O$ 的异氰酸酯，结构式 $R'-N=C=S$ 的异硫氰酸酯和结构式 $R^1-S(O)_q-Cl$ 的硫亲电子试剂是已知的化合物或可以由所属技术领域的专业人员利用已知的方法从已知的化合物形成。

结构式 4 的化合物可以通过结构式 5 的化合物与结构式 6 的化合物在 0°C 和 100°C 之间的温度下在有机溶剂如二氯甲烷、氯仿或 1,2-二氯乙烷中在酸如氢氟酸或三氟乙酸和助溶剂如水、甲醇或乙醇的存在下，或在路易斯酸性金属盐如二卤化锌(II)存在下进行反应来获得。所形成的中间体(结构式 4a 的化合物)随后用亲核试剂 R^3-M (其中 M 是金属物质。 R^3-M 是例如格利雅试剂)或，当 R^3 是氢时，还原剂如硼氢化钠、(三乙酰氧基)氢硼化钠，氰基硼氢化钠或类似物，在环境温度下在有机溶剂如乙醇或氯仿中进行处理。该基本方法描述在四面体(1997), 53, 10983-10992 中。

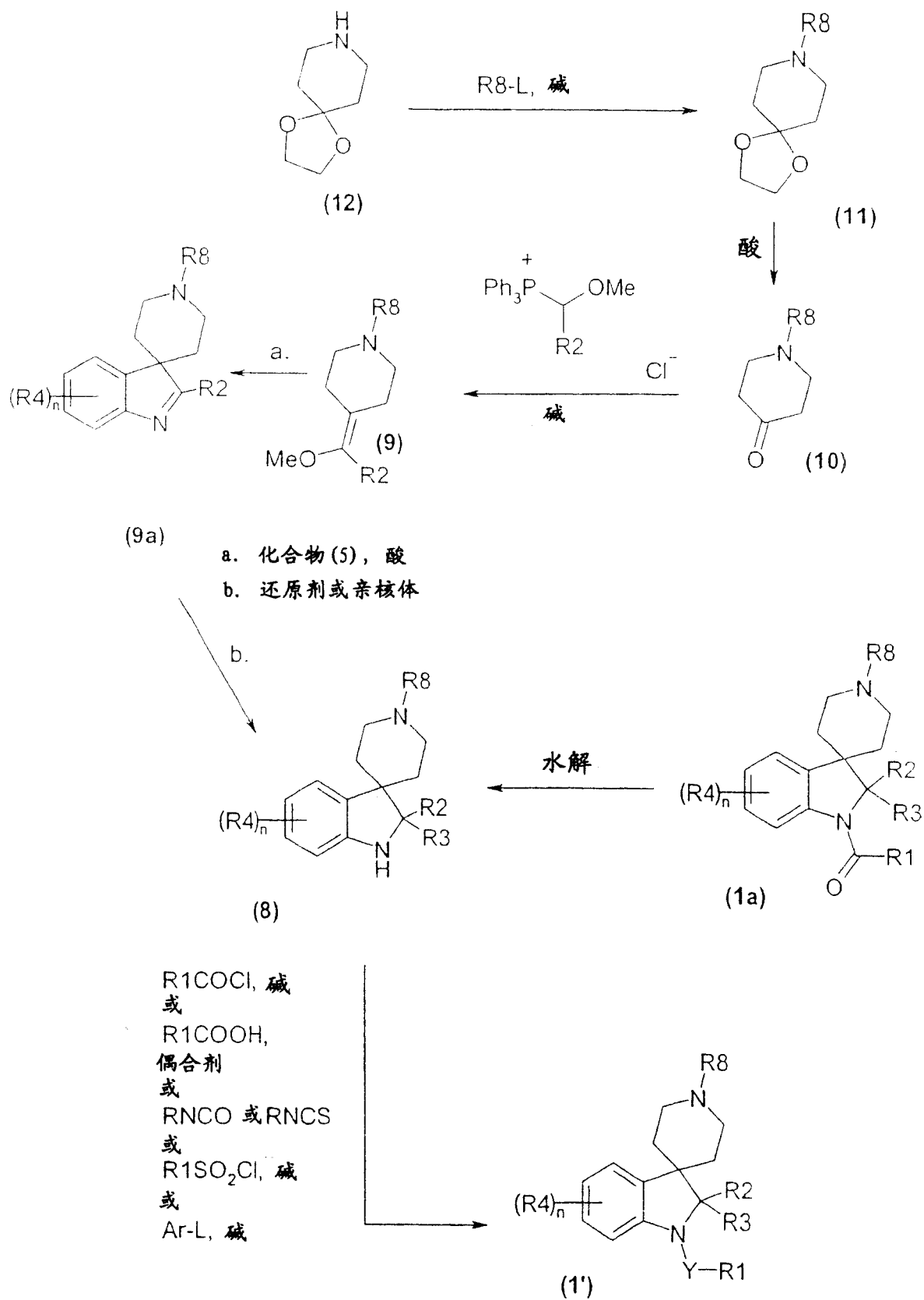
结构式 6 的化合物可以由结构式 7 的化合物与 1-烷氧基取代的膦盐如甲氧基甲基(三苯基)磷翁氯化物和碱如叔丁醇钾在 0°C 到室温之间的温度下在四氢呋喃中进行反应来获得。

结构式 5 和 7 的化合物是已知的化合物或可以由已知的技术从已知的化合物获得。

结构式 2, 3, 4, 4a 和 6 的某些化合物是新型的和因此构成了本发明的又一方面。

制备结构式 1' 的化合物(其中 R^2 , R^3 , R^9 和 R^{10} 全部是氢的结构式 I 的化合物)的其它方法在下面的反应历程 II 中举例说明。

反应历程 II



因此结构式 1' 的化合物可以通过结构式 8 的化合物与结构式 $R1COCl$ 的酰氯或氯甲酸酯在 $0^{\circ}C$ 和环境温度之间的温度下, 在有机溶剂如二氯甲烷、氯仿或 1, 2-二氯乙烷中在叔胺碱如三乙胺或二异丙基乙胺存在下进行反应来获得。

另外地, 结构式 1' 的化合物可以通过结构式 8 的化合物与结构式 $R1COOH$ 的羧酸和标准偶联剂如 2-氯-1, 3-二甲基-2-咪唑酮六氟磷酸盐, 或碳化二亚胺试剂如二环己基碳化二亚胺或 1-(3-二甲基氨基丙基)-3-乙基碳化二亚胺盐酸盐在 $0^{\circ}C$ 和环境温度之间的温度下, 在有机溶剂如二氯甲烷或四氢呋喃中在叔胺碱如三乙胺或二异丙基乙胺存在下进行反应来获得。

结构式 1' 的化合物可以另外地由结构式 8 的化合物与分别具有结构式 $RNCO$ 或 $RNCS$ 的异氰酸酯或异硫氰酸酯, 在 $0^{\circ}C$ 和环境温度之间的温度下, 在有机溶剂如二氯甲烷或四氢呋喃中, 任选在叔胺碱如三乙胺或二异丙基乙胺存在下进行反应来获得。

结构式 1' 的化合物也可以由结构式 8 的化合物与结构式 $R1SO_2Cl$ 的磺酰氯在 $0^{\circ}C$ 和环境温度之间的温度下, 在有机溶剂如二氯甲烷或四氢呋喃中, 在叔胺碱如三乙胺或二异丙基乙胺存在下进行反应来获得。

另外地, 结构式 1' 的化合物可以由结构式 8 的化合物与结构式 $Ar-L$ 的芳基或杂芳基化合物, 其中 L 是离去基团如卤素(尤其氟), 如 2-卤代吡啶、2-卤嘧啶、4-卤代吡啶、2-卤吡嗪或类似物, 在 $50^{\circ}C$ 和 $150^{\circ}C$ 之间的温度下在溶剂如二甲亚砜中在强碱如氢氧化钠存在下进行反应来获得。

结构式 8 的化合物可以通过结构式 9 的化合物与结构式 5 的化合物(在反应历程 I 中), 在环境温度的和 $100^{\circ}C$ 之间的温度下在有机溶剂如二氯甲烷、氯仿或 1, 2-二氯乙烷中在酸如三氟乙酸存在下反应典型地 4 到 12 小时, 随后添加还原剂如三乙基硅烷和在环境温度至 $100^{\circ}C$ 下反应直到该反应完成为止来获得。

另外地, 结构式 8 的化合物可以通过结构式 9 的化合物与结构式

5 的化合物在 0°C 和 100°C 之间的温度下，在有机溶剂如二氯甲烷、氯仿或 1,2-二氯乙烷中在酸如氢氟酸或三氟乙酸以及水或甲醇或乙醇的助溶剂存在下，或在路易斯性金属盐如卤化锌(II)存在下进行反应来获得。所形成的中间体(结构式(9a)的化合物)随后用还原剂如硼氢化钠，(三乙酰氧基)氢硼化钠，氰基硼氢钠或类似物在环境温度下在有机溶剂如乙醇或氯仿中进行处理。

结构式 8 的化合物也可以由结构式 1a 的化合物(它也是亚组的结构式 1 的化合物)在回流温度下的水解作用，优选含 6N 氢氟酸，来获得。

结构式 9 的化合物可以通过结构式 10 的化合物与甲氧基甲基(三苯基)磷翁氯化物或相应溴化物盐和碱如叔丁醇钾在 0°C 到环境温度之间的温度下在四氢呋喃中进行反应来获得。

结构式 10 的化合物可以通过结构式 11 的化合物与酸的水溶液，典型地 6N 氢氟酸，在回流温度下进行反应来获得。

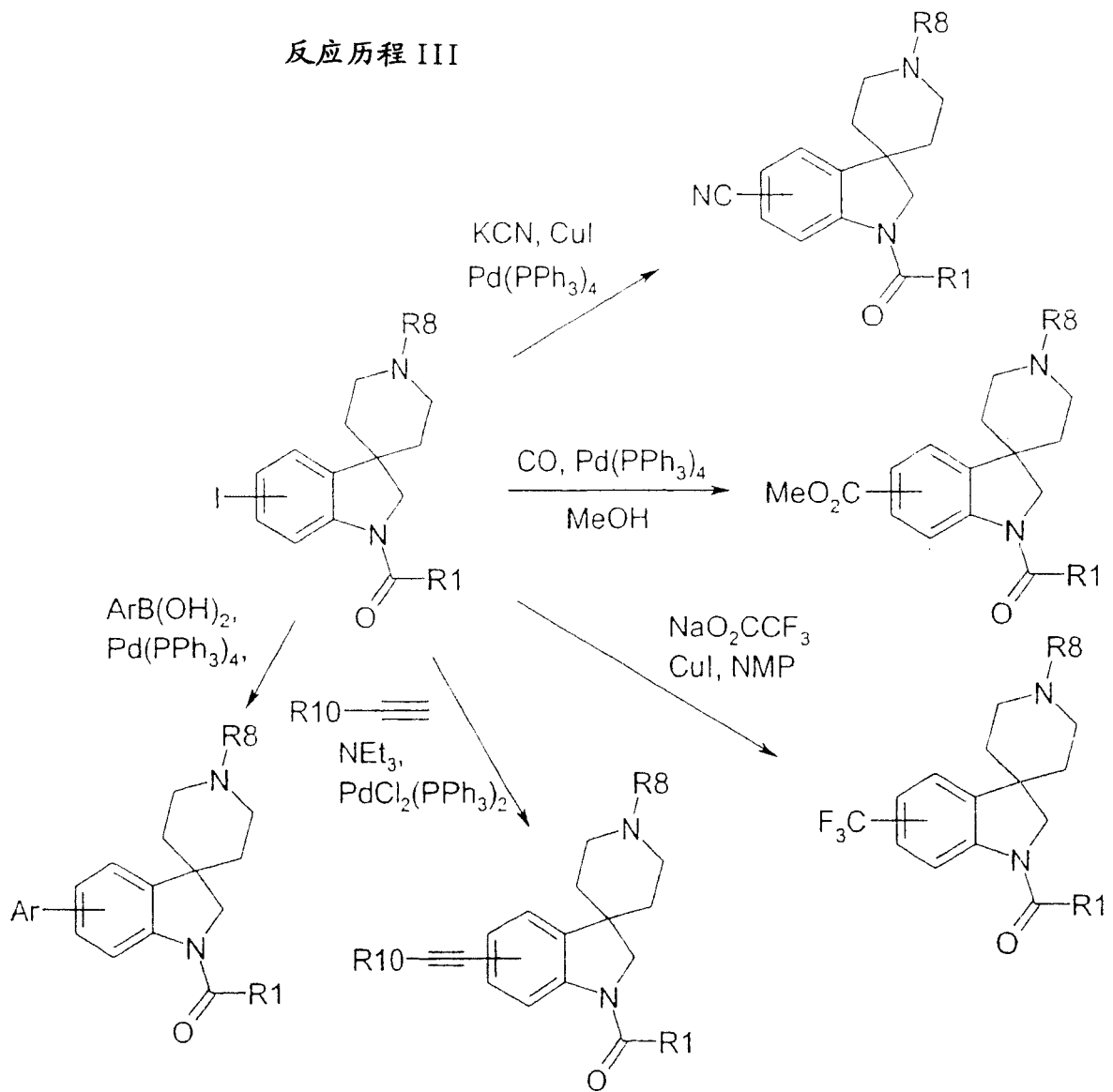
结构式 11 的化合物可以由结构式 12 的化合物与结构式 R8-L 的亲电子试剂，其中 L 是氯、溴、碘或磺酸根(例如甲磺酸根或甲苯磺酸根)或类似的离去基团，在环境温度和 100°C 之间的温度下，典型地在 60°C 下在有机溶剂如二氯甲烷、氯仿或 1,2-二氯乙烷中，在过量的叔胺碱如三乙胺或二异丙基乙胺存在下和任选被卤化物盐如碘化钠、碘化钾或碘化四丁铵催化，进行反应来获得。

结构式 12 的化合物是已知的化合物或可以由已知的技术从已知的化合物获得。

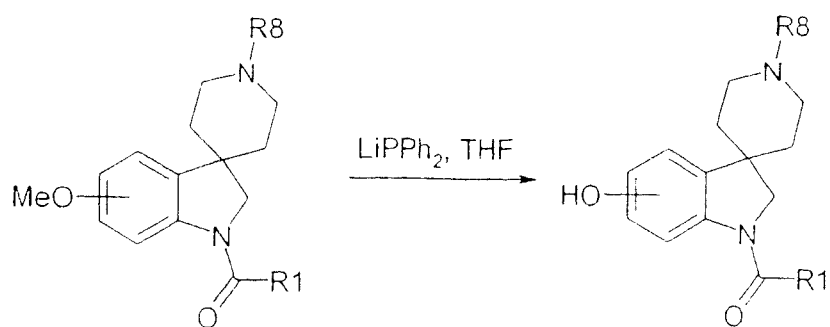
结构式 8, 9, 9a, 10 和 11 的某些化合物是新型的和因此构成了本发明的附加方面。

本领域中的技术人员容易地认识到，有可能让结构式 I 的一种化合物相互转化成结构式 I 的其它化合物和此类方法的例子给出在下面的反应历程 III, IV, V, Va 和 VI 中。

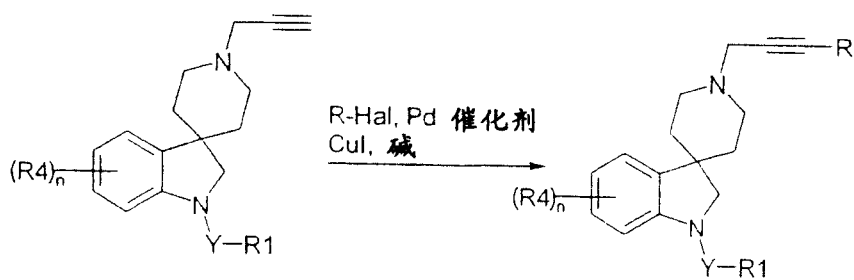
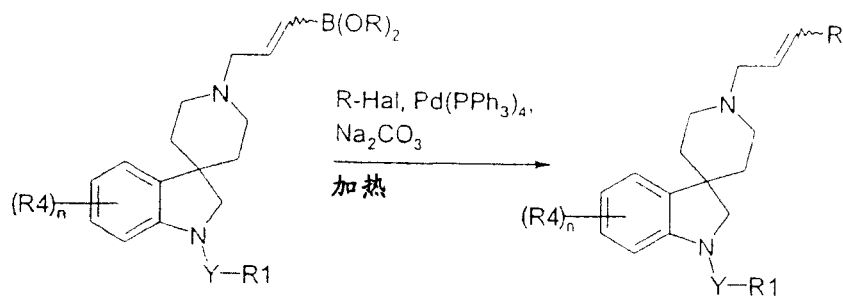
反应历程 III



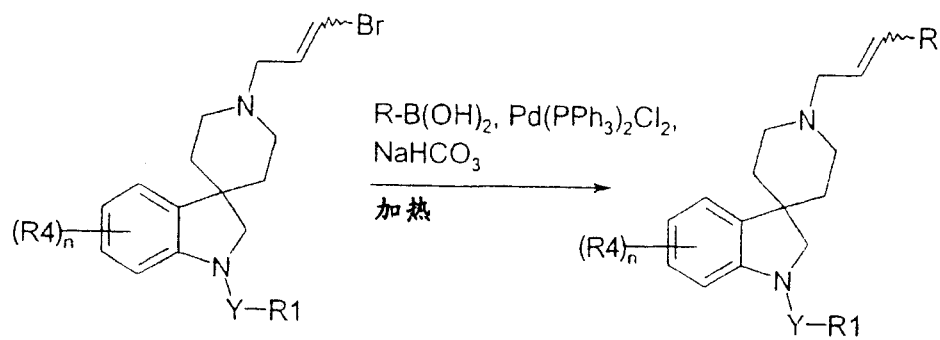
反应历程 IV



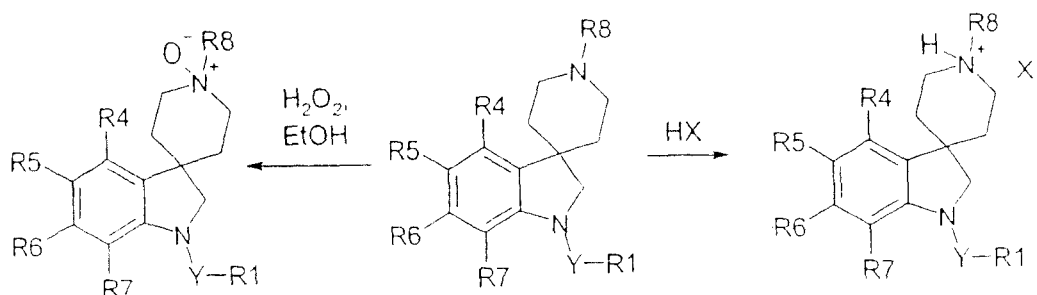
反应历程 V



反应历程 VA

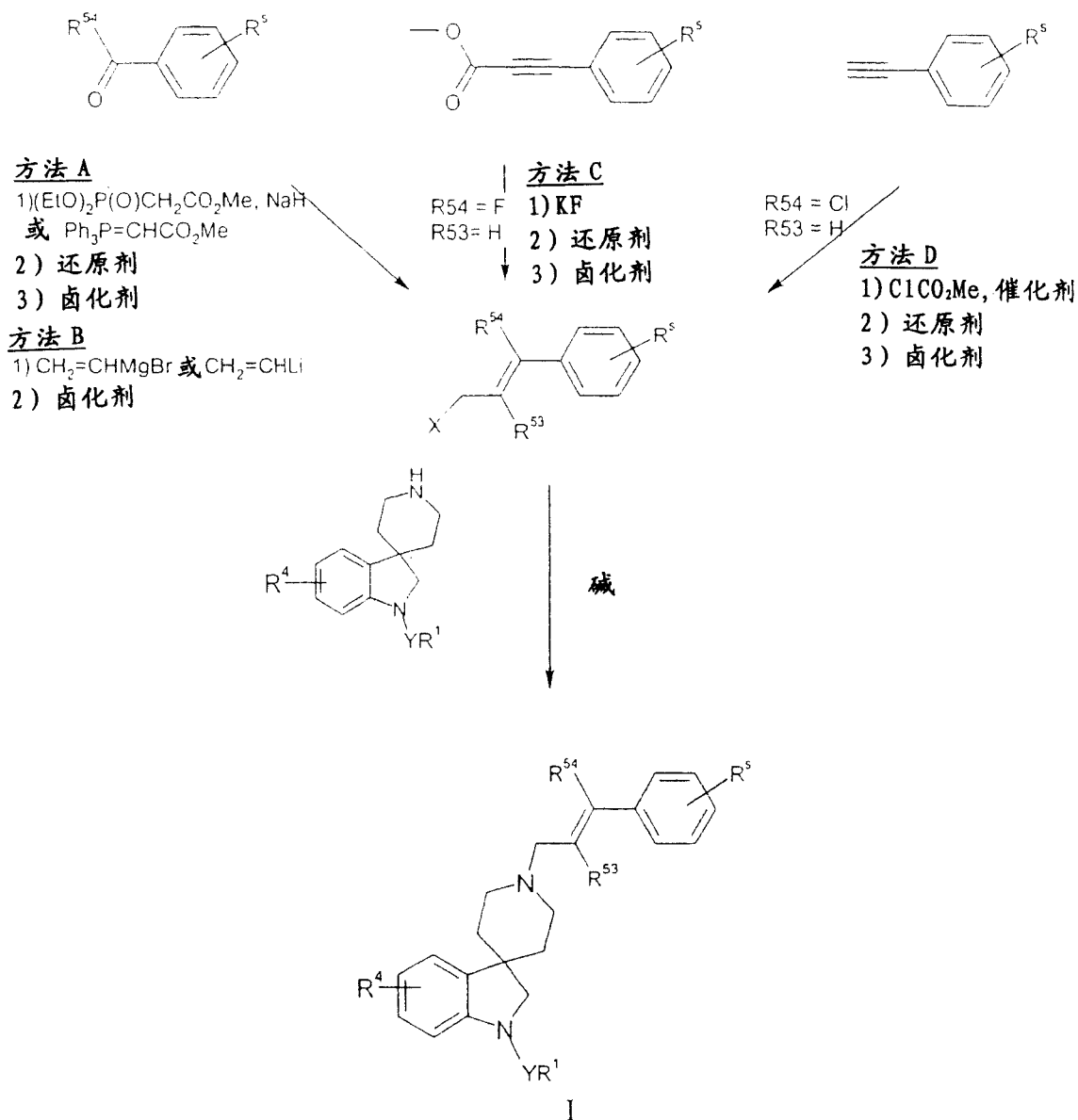


反应历程 VI

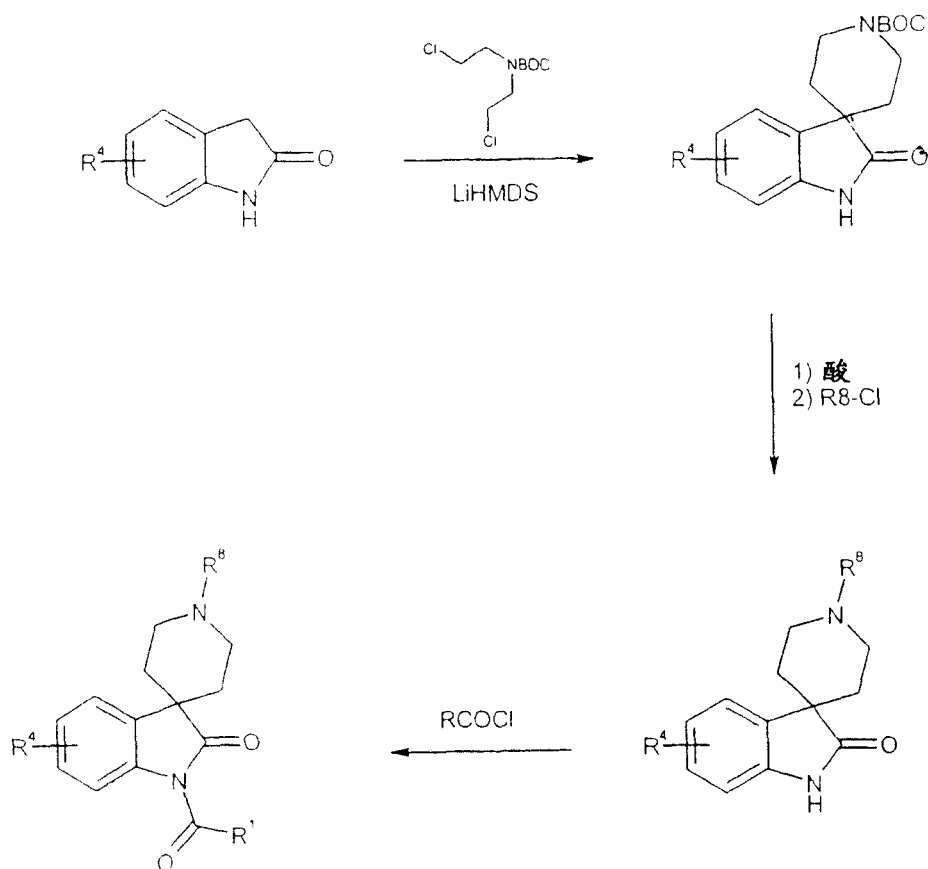


其中 R⁸ 是任选被取代的肉桂基的结构式 I 的化合物可以利用在下面的反应历程 VII 中的反应来制备, 其中 R⁴, R⁵³, R⁵⁴ 和 R⁸ 如上所定义。该反应历程在实施例 8-12 中进行举例说明。

反应历程 VII

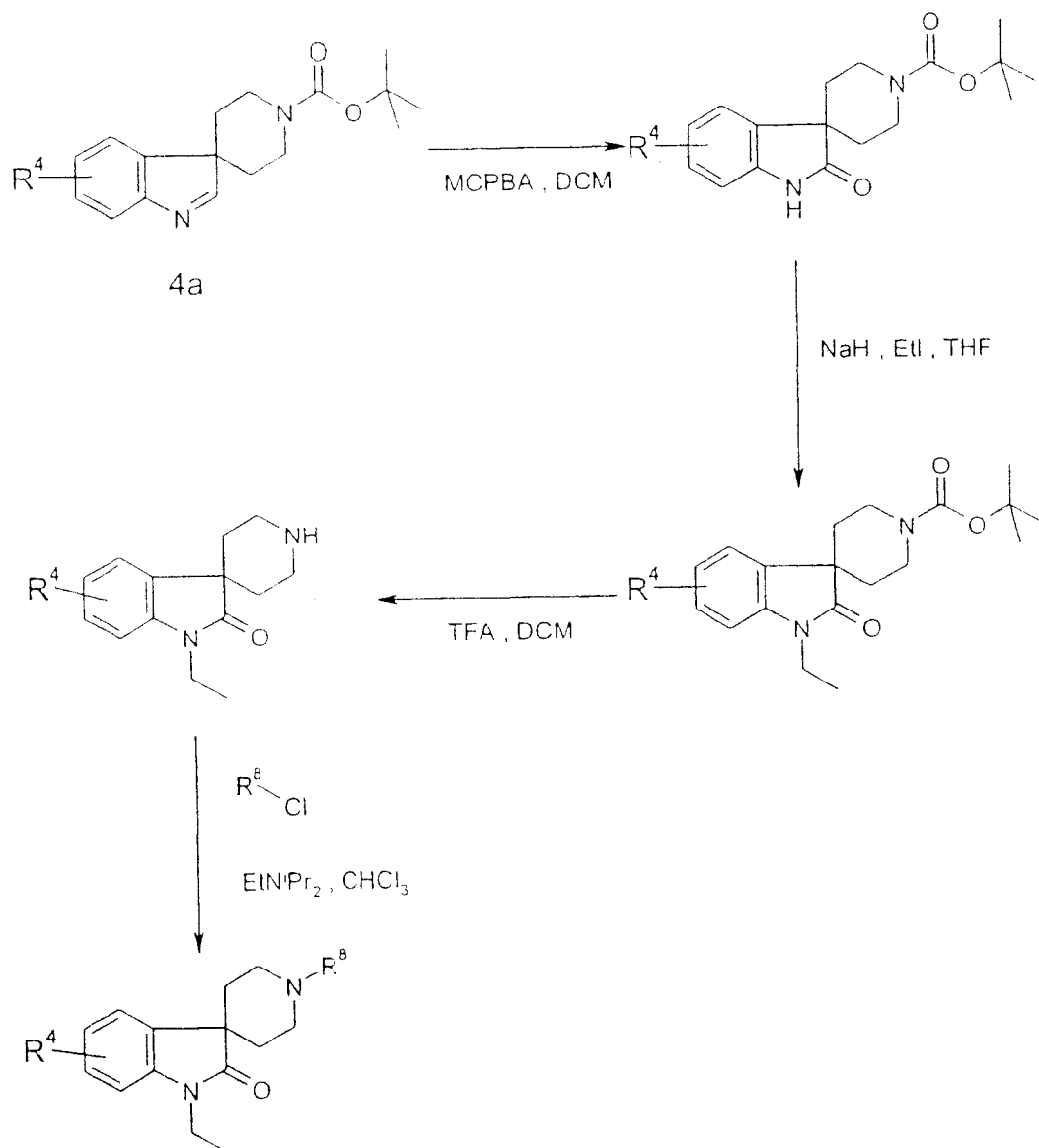


反应历程 VIII



其中 R^2 和 R^3 一起是氧代基团和 R^8 如上所定义的结构式 (I) 的化合物是由下面的反应历程 IX 的方法从结构式 4a 的化合物制备的。

反应历程 IX



结构式(I)的化合物可用于抗击和控制害虫如鳞翅目, 双翅目, 半翅目, 缨尾目, 直翅目, 网翅目, 鞘翅目, 蚤目, 膜翅目和等翅目以及其它的无脊椎的害虫, 例如, 螨虫, 线虫和软体动物害虫的侵害。昆虫, 螨虫, 线虫和软体动物在以下总称为害虫。可以用本发明化合物抗击和控制的害虫包括与农业(该术语包括食用和纤维产品的作物种植), 园艺和畜牧业, 陪伴动物, 林业以及植物来源的产品(如水果, 谷粒和木料)的贮存有关的那些害虫; 与人造结构的损坏以及人类和动

物的疾病的传播有关的那些害虫；以及讨厌的害虫(如苍蝇)。

可以由结构式(I)的化合物控制的害虫类的例子包括:桃蚜,棉蚜,豆卫矛蚜,草盲蝽属,棉红蝽属,褐飞虱,黑尾叶蝉,绿蝽属, *Euschistus* spp., 稻缘蝽属,西花蓟马,蓟马属,马铃薯叶甲,棉铃象,肾圆盾蚧属,粉虱属,甘薯粉虱,欧洲玉米螟,棉贪夜蛾,烟芽夜蛾,棉铃虫,谷实夜蛾,棉卷叶野螟,欧洲粉蝶,小菜蛾,地夜蛾属,二化螟,飞蝗(*Locusta migratoria*), 澳洲疫蝗, *Diabrotica* spp., 苹果全爪螨,柑桔全爪螨,二斑叶螨,朱砂叶螨,柑桔皱叶刺瘿螨,侧多食跗线螨,短须螨属,微小牛蜱,变异革蜱,猫蚤,斑潜蝇属,家蝇,埃及伊蚊,按蚊属,库蚊属,绿蝇属(*Lucillia* spp.), 德国小蠊,美洲大蠊,东方蜚蠊,澳白蚁科(例如澳白蚁属),木白蚁科(例如新白蚁属),鼻白蚁科例如台湾乳白蚁,欧美散白蚁,黄胸散白蚁,南方散白蚁,美国散白蚁,和 *Reticulitermes santonensis*)和该白蚁科(例如黄球白蚁),火蚁,小家蚁,畜虱属和颚虱属,根结线虫属,球异皮线虫属和异皮线虫属,短体线虫属, *Rhodopholus* spp., 小垫刃线虫属,捻转血矛线虫(*Haemonchus contortus*), *Caenorhabditis elegans*, 毛圆线虫属(*Trichostrongylus* spp.)和 *Deroceras reticulatum*。

本发明因此提供了抗击并控制昆虫、螨虫、线虫或软体动物的方法,它包括对害虫,害虫的栖息地,或对容易受到害虫侵害的植物使用杀昆虫、杀螨虫、杀线虫或杀软体动物有效量的结构式(I)的化合物,或含有结构式(I)的化合物的组合物,结构式(I)的化合物优选用于抵抗昆虫,螨虫或线虫。

在这里使用的术语“植物”包括幼苗、丛生灌木和树。

为了将结构式(I)的化合物作为杀虫剂,杀螨剂,杀线虫剂或杀软体动物剂施用于害,害虫的栖息地,或容易受到害虫侵害的植物上,结构式(I)的化合物通常被配制成组合物,该组合物除包括结构式(I)的化合物外还包括合适的情性稀释剂或载体和任选的表面活性剂(SFA)。SFA是能够通过降低界面张力来改进界面(例如,液体/固体,液体/空气或液体/液体界面)的性能和因此导致其它性能(例如分散,

乳化和润湿)的变化的化学品。优选的是全部组合物(固体和液体配制料)包括,按重量,0.0001到95%,更优选1到85%,例如5到60%,的结构式(I)的化合物。组合物一般被用于害虫的控制,要求结构式(I)的化合物是以0.1g到10kg/每公顷,优选1g到6kg/每公顷,更优选1g到1kg/每公顷的比率使用。

当用于拌种时,结构式(I)的化合物是以0.0001g到10g(例如0.001g或0.05g)的比率,优选0.005g至10g,更优选0.005g到4g,每千克种子的比率使用。

在本发明的另一个方面,提供杀虫、杀螨虫、杀线虫或杀软体动物的组合物,它包括杀虫、杀螨虫、杀线虫或杀软体动物有效量的结构式(I)的化合物和合适的载体或稀释剂。组合物优选是杀虫、杀螨虫、杀线虫或杀软体动物组合物。

在本发明的仍然再一个方面提供了在栖息地抗击和控制害虫的方法,它包括用杀害虫、杀螨虫、杀线虫或杀软体动物有效量的包括结构式(I)的化合物的一种组合物处理该害虫或害虫的栖息地。结构式(I)的化合物优选抗击昆虫,螨虫或线虫。

组合物能够选自各种配制料类型,其中包括可喷粉的粉末(DP),可溶性粉剂(SP),水溶性颗粒剂(SG),水可分散的粒料(WG),可湿性粉剂(WP),粒料(GR)(缓慢或快速释放的),可溶性浓缩物(SL),油混溶性液体(OL),超低容量液体(UL),可乳化浓缩物(EC),可分散的浓缩物(DC),乳液(水包油型(BW)和油包水型(EO)),微乳液(ME),悬浮剂(SC),气溶胶,雾化/烟雾配制料,胶囊悬浮液(CS)和种子处理配制料。在任情况下选择的配制料类型将取决于所设想的具体目的以及结构式(I)的化合物的物理、化学和生物学特性。

可喷粉的粉剂(DP)可以通过将结构式(I)的化合物与一种或多种固体稀释剂(例如天然粘土,高岭土,叶卉石,膨润土,氧化铝,蒙脱土,硅藻土,白垩,硅藻土,磷酸钙,钙和镁碳酸盐,硫,石灰,面粉,滑石和其它有机和无机固体载体)混合并以机械方式研磨该混合物成为细粉末来制得。

可溶性粉剂 (SP) 可以通过将结构式 (I) 的化合物和一种或多种水溶性的无机盐 (如碳酸氢钠, 碳酸钠或硫酸镁) 或一种或多种水溶性的有机固体 (如多糖) 和任选的一种或多种润湿剂, 一种或多种分散剂或此类试剂的混合物进行混合来制备, 以改进水分散性/溶解度。混合物然后研磨成细粉末。类似的组合物也可以制成粒, 形成水溶性颗粒剂 (SG)。

可湿性粉剂 (WP) 可以通过将结构式 (I) 的化合物和一种或多种固体稀释剂或载体, 一种或多种润湿剂和, 优选, 一种或多种分散剂和任选的一种或多种悬浮剂混合来制备, 以促进在液体中的分散。混合物然后研磨成细粉末。类似的组合物也可以制成粒状, 形成水可分散的粒料 (WG)。

粒料 (GR) 可以通过将结构式 (I) 的化合物和一种或多种粉末状固体稀释剂或载体的混合物制成粒状, 或通过将结构式 (I) 的化合物 (或它的溶液, 在合适的溶剂中) 吸附在多孔性粒状材料 (如浮石, 山软木土, 漂白土, 硅藻石, 硅藻土或磨碎的玉米棒) 中或将结构式 (I) 的化合物 (或它的溶液, 在合适的溶剂中) 吸附在硬核材料 (如沙, 硅酸盐, 矿物碳酸盐, 硫酸盐或磷酸盐) 上并干燥 (如果必要) 来形成。通常用于协助吸收或吸附的试剂包括溶剂 (如脂肪族和芳族石油溶剂, 醇, 醚, 酮和酯) 和粘着剂 (如聚乙酸乙烯酯, 聚乙烯醇, 糊精, 糖和植物油)。一种或多种其它添加剂也包括在粒料中 (例如乳化剂, 润湿剂或分散剂)。

可分散的浓缩物 (DC) 可以通过将结构式 (I) 的化合物溶于水或有机溶剂如酮, 醇或乙二醇醚中来制备。这些溶液可含有表面活性剂 (例如改进水稀释或防止在喷雾箱中结晶)。

可乳化的浓缩物 (EC) 或水包油型乳液 (EW) 可以通过将结构式 (I) 的化合物溶于有机溶剂 (任选含有一种或多种润湿剂, 一种或多种乳化剂或此类试剂的混合物) 中来制备。用于 EC 中的合适的有机溶剂包括芳族烃 (如烷基苯或烷基萘, 例如 SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 和 SOLVESSO 200; SOLVESSO 是注册商标), 酮类 (如环己酮或甲基环己酮)

和醇类(如苜醇, 糠醇或丁醇), N-烷基吡咯烷酮类(如 N-甲基吡咯烷酮或 N-辛基吡咯烷酮), 脂肪酸的二甲基酰胺类(如 C₈-C₁₀ 脂肪酸二甲基酰胺)和氯化烃类。EC 产品可以在添加到水中后自发地乳化, 得到具有足够稳定性的乳液, 从而可通过合适的设备喷雾。EW 的制备包括获得结构式(I)的化合物, 作为液体(如果在室温下它不是液体, 则可以在合理的温度下, 典型地在 70°C 下熔化)或在溶液中(将它溶于合适的溶剂中), 然后将所形成的液体或溶液在高剪切作用下乳化在含有一种或多种 SFA 的水中, 生产乳液。用于 EW 的合适溶剂包括植物油, 氯化烃类(如氯苯), 芳香族溶剂(如烷基苯或烷基萘)和在水中具有低溶解度的其它合适的有机溶剂。

微乳液(ME)可以制通过将水与一种或多种溶剂和一种或多种 SFA 的掺混物进行混合, 自发地生产出热力学稳定的各向同性的液体配制料来制得。结构式(I)的化合物最初存在于水中或溶剂/SFA 掺混物中。用于 ME 的合适溶剂包括以上对用于 EC 或用于 EW 中所描述的那些溶剂。ME 可以是水包油型或油包水型体系(该体系的存在可以由导电率测量测定)和适合将水溶性和油溶性杀虫剂混合在同一配制料中。ME 适合于稀释到水中, 保持为微乳液或形成了普通的水包油型乳液。

悬浮浓缩物(SC)可以包括结构式(I)的化合物的细分散的不溶性固体颗粒的含水或无水的悬浮液。SC 可通过将结构式(I)的固体化合物在合适的介质中, 任选有一种或多种分散剂, 进行球磨或珠粒磨, 生产该化合物的细颗粒悬浮液来制备。一种或多种润湿剂可以包括在组合物中和包括悬浮剂以降低颗粒沉降的速率。另外地, 结构式(I)的化合物可以进行干磨和添加到含有上述试剂的水中, 生产所需的最终产物。

气雾剂包括结构式(I)的化合物和合适的推进剂(例如正丁烷)。结构式(I)的化合物也可以溶于或分散于合适的介质(例如水或与水混溶性的液体, 如正丙醇)中而得到可用于非增压的、手工操纵的喷雾器唧筒中的组合物。

结构式(I)的化合物能够以干燥状态与烟火混合物进行混合而形

成组合物，后者适合于在围蔽空间中产生含有该化合物的烟雾。

胶囊悬浮液 (CS) 可以与 EW 配制料的制备类似的方式，但使用附加的聚合阶段，来制备，从而获得油雾雾珠的水性分散体，其中各油滴被聚合物壳包封并含有结构式 (I) 的化合物和任选的载体或稀释剂。该聚合物壳可以由界面缩聚反应或由凝聚程序生产。组合物可以允许结构式 (I) 的化合物的控制释放和它们可以用于种子处理。结构式 (I) 的化合物也可以在可生物降解的聚合物基质中配制，以实现化合物的缓慢的、控制的释放。

组合物可以包括一种或多种添加剂以改进组合物的生物特性 (例如通过改进在表面上的润湿，保留或分布；对在所处理表面上的雨水的耐水性；或结构式 (I) 的化合物的吸取或迁移性)。此类添加剂包括表面活性剂，以油剂为基础的喷雾添加剂，例如某些矿物油或天然的植物油剂 (大豆油和菜籽油)，和这些与其它生物增强助剂 (协助或改善结构式 (I) 的化合物的作用的成分) 的共混物。

结构式 (I) 的化合物也可以经过配制用作种子处理剂，例如用作粉末组合物，其中包括用于干种子处理 (DS) 的粉末，水溶性粉剂 (SS) 或用于淤浆处理 (WS) 的水可分散性粉末，或用作液体组合物，后者包括流动性的浓缩物 (FS)，溶液 (LS) 或胶囊悬浮液 (CS)。DS, SS, WS, FS 和 LS 组合物的制备分别地非常类似于如上所述的 DP, SP, WP, SC 和 DC 组合物的制备。用于处理种子的组合物包括协助组合物粘合于种子上的试剂 (例如矿物油或成膜性阻隔剂)。

润湿剂，分散剂和乳化剂可以是阳离子，阴离子，两性或非离子类型的 SFA。

阳离子类型的合适 SFA 包括季铵化合物 (例如溴化十六烷基三甲铵)，咪唑啉和胺盐。

合适的阴离子 SFA 包括脂肪酸碱金属盐，硫酸脂肪族单酯的盐 (例如十二烷硫酸钠)，磺化芳香族化合物的盐 (例如十二烷基苯磺酸钠，十二烷基苯磺酸钙，丁基萘磺酸盐以及二-异丙基-和三-异丙基-萘磺酸钠的混合物)，醚类硫酸盐，醇醚硫酸盐 (例如 laureth-3-硫酸钠)，

醚类羧酸盐(例如 laureth -3-羧酸钠), 磷酸酯(从一种或多种脂肪醇和磷酸(主要为单酯)或五氧化二磷(主要为双酯)之间的反应, 例如在月桂醇和四磷酸之间的反应, 得到的产物; 另外这些产物可以乙氧基化), 磺基琥珀酸酯盐, 链烷烃或烯烃磺酸盐, 氨基乙磺酸盐和木质素磺酸盐。

两性类型的合适 SFA 包括甜菜碱, 丙酸盐和甘氨酸盐。

非离子类型的合适 SFA 包括烯化氧, 如环氧乙烷, 环氧丙烷, 环氧丁烷或它们的混合物, 与脂肪醇(如油醇或十六烷醇)或与烷基酚(如辛基苯酚, 壬基酚或辛基甲酚)的缩合产物; 从长链脂肪酸或己糖醇酸酐形成的部分酯; 该部分酯与环氧乙烷的缩合产物; 嵌段共聚物(包括环氧乙烷和环氧丙烷); 链烷醇酰胺; 简单的酯(例如脂肪酸聚乙二醇酯); 氧化胺(例如十二烷基二甲氧化胺); 和卵磷脂。

合适的悬浮剂包括亲水胶体(如多糖, 聚乙烯吡咯烷酮或羧甲基纤维素钠)和膨胀粘土(如膨润土或绿坡缕石)。

结构式(I)的化合物可以由施用杀虫化合物的任何已知的方式来施用。例如, 它可以, 经过配制或未配制, 被直接地施用于害虫或害虫的生存场所(如害虫的栖息地, 或易于受害虫侵害的生长植物)或施用于植物的任何部分上, 包括叶, 茎, 支或根, 施用于种植之前的种子上或施用于植物生长或种植的其它介质(如根周围的土壤, 一般所说的土壤, paddy 水或溶液培养体系), 或被喷雾, 涂粉, 浸泡施用, 作为乳油剂或浆料配制料施用, 作为蒸气施用或通过组合物(如微粒状组合物或包在水溶性的袋中的组合物)分配或引入在土壤或含水环境中来施用。

结构式(I)的化合物也可注射到植物中或使用电学喷雾技术或其它低容量方法喷雾到植物体上, 或地面或空中灌溉系统施用。

用作含水制剂的组合物(水溶液或分散体)一般是以含有高比例的活性成分的浓缩物形式提供, 该浓缩物在施用之前被添加到水中。这些浓缩物, 它们包括 DC, SC, EC, EW, ME, SG, SP, WP, WG 和 CS, 常常需要经受住长时间的储存并且在储存之后能够添加到水中形成含

水制剂，后者在足够的时间中保持均匀以使得它们能够由普通的喷雾设备施用。此类含水制剂可以含有各种量的结构式(I)的化合物(例如0.0001到10%，按重量)，这取决于使用它们的目的。

结构式(I)的化合物可以与肥料(例如含有氮-，钾-或磷-的肥料)混合物使用。合适的配制料类似包括肥料的粒料。混合物合适地含有至多25wt%的结构式(I)的化合物。

本发明因此还提供了包括肥料和结构式(I)的化合物的肥料组合物。

本发明的组合物可以含有具有生物活性的其它化合物，例如微量营养素或具有杀菌活性的化合物，或这些化合物具有植物生长调节，除草，杀虫，杀线虫或杀螨活性。

结构式(I)的化合物可以是组合物的唯一活性成分或它可以与一种或多种附加活性成分，如杀虫剂，杀真菌剂，增效剂，除草剂或植物生长调节剂进行掺混，若合适的话。附加活性成分可以：提供具有广谱的活性或在生存场所延长持久性的组合物；增效或补充结构式(I)化合物的活性(例如增加起效的速度或克服排斥性)；或有助于克服或防止对各组分的耐受性的产生。具体的附加活性成分取决于组合物的预定用途。合适的杀虫剂的例子包括下列：

a) 拟除虫菊酯，如氯菊酯，氟氯菊酯，氟戊菊酯，高氟戊菊酯，溴氟菊酯，氟氟菊酯(尤其 λ -氟氟菊酯)，氟菊酯，甲氟菊酯，氟氟菊酯，七氟菊酯，鱼安全的拟除虫菊酯(例如醚菊酯)，天然的除虫菊酯，胺菊酯，S-生物烯丙菊酯，五氟苯菊酯，炔酮菊酯或5-苄基-3-咪喃基甲基-(E)-(1R,3S)-2,2-二甲基-3-(2-oxothiolan-3-叉基甲基)环丙烷羧酸酯；

b) 有机磷酸酯，如，丙溴磷，甲丙硫磷，乙酰甲胺磷，甲基对硫磷，保棉磷，甲基内吸磷，庚烯磷，二甲硫吸磷，虫胺磷，久效磷，丙溴磷，三唑磷，甲胺磷，乐果，磷胺，马拉硫磷，毒死蜱，伏杀硫磷，特丁磷，线虫磷，地虫硫磷，甲拌磷，辛硫磷，甲基嘧啶磷，嘧啶磷，杀螟硫磷，噻唑磷或二嗪磷；

c) 氨基甲酸酯类(包括芳基氨基甲酸酯类)，如抗蚜威，啮蚜威

(triazamate), 除线威, 克百威, 呋线威, 乙硫苯威, 涕灭威, thiofurox, 丁硫克百威, 噁虫威, 仲丁威, 残杀威, 灭多威或杀线威;

d) 苯甲酰脲类, 如除虫脲, 杀虫隆, 氟铃脲, 氟虫脲或定虫隆;

e) 有机锡化合物, 如三环锡, 苯丁锡或三唑锡;

f) 吡唑类, 如吡螨胺和唑螨酯;

g) 大环内酯, 如齐墩螨素 (avermectin) 或密比霉素 (milbemycin), 例如齐墩螨素, 埃玛菌素, 齐墩螨素 (ivermectin), 密比霉素 (milbemycin), 多杀菌素或印楝素;

h) 激素或信息素;

i) 有机氯化物, 如硫丹, 林丹, 滴滴涕, 氟丹或狄氏剂;

j) 脘类, 如杀虫脘或双虫脘;

k) 熏蒸剂, 如氯化苦 (chloropicrin), 二氯丙烷, 甲基溴 (methyl bromide) 或威百亩;

l) 氯烟碱基化合物, 如吡虫啉, 噻虫啉, 啉虫咪, 烯啉虫胺或噻虫嗪;

m) 二酰基胍, 如虫酰胍, 环虫酰胍或甲氧虫酰胍;

n) 二苯醚, 如苯虫醚或蚊蝇醚;

o) 茛虫威;

p) 溴虫腈; 或

q) 吡蚜酮。

除了以上所列的主要化学品类型的杀虫剂, 具有特殊用途的其它杀虫剂可以用于该组合物中, 如果适合于该组合物的预定用途的话。例如, 对于具体农作物的选择性杀虫剂, 例如可以使用蛀茎虫有特效的杀虫剂 (如杀螟丹) 或跳虫有特效的杀虫剂 (如噻嗪酮)。另外地, 对于特殊的昆虫类/阶段有特效的杀虫剂或杀螨剂也可以包括在该组合物中 (例如螨虫卵-幼虫杀灭剂, 如四螨嗪, 氟螨嗪, 噻螨酮或三氯杀螨砒; 杀螨虫的 motilicid, 如三氯杀螨醇或克螨特; 杀螨剂, 如溴螨酯或乙酯杀螨醇; 或植物生长调节剂, 如伏蚁脘, 灭蝇胺, 烯虫酯, 定虫隆或除虫脲)。

包括在本发明的组合物中的杀真菌的化合物的例子是(E)-N-甲基-2-[2-(2,5-二甲基苯氧基甲基)苯基]-2-甲氧基-亚胺基乙酰胺(SSF-129), 4-溴-2-氟基-N,N-二甲基-6-三氟甲基苯并咪唑-1-磺酰胺, α -[N-(3-氯-2,6-二甲基苯基)-2-甲氧基乙酰胺基]- γ -丁内酯, 4-氯-2-氟基-N,N-二甲基-5-对-甲苯基咪唑-1-磺酰胺类(IKF-916, cyamidazosulfamid), 3,5-二氯-N-(3-氯-1-乙基-1-甲基-2-氧代丙基)-4-甲基苯甲酰胺(RH-7281, zoxamide), N-烯丙基-4,5-二甲基-2-三甲基甲硅烷基噻吩-3-羧酰胺(MON65500), N-(1-氟基-1,2-二甲基丙基)-2-(2,4-二氯苯氧基)丙酰胺(AC382042), N-(2-甲氧基-5-吡啶基)-环丙烷羧酰胺, acibenzolar(CGA245704), 棉铃威, aldimorph, 敌菌灵, 戊环唑, 嘧菌酯, 苯霜灵, 多菌灵, 双苯三唑醇(biloxazol), 双苯三唑醇(bitertanol), 灭瘟素, 糠菌唑, 乙嘧酚磺酸酯, 敌菌丹, 克菌丹, 多菌灵, 多菌灵羟基氯化物, 萎锈灵, 环丙酰菌胺, 香芹酮(carvone), CGA41396, CGA41397, 灭螨猛, 百菌清, chlorozolinate, clozylacon, 含铜的化合物如王铜, 铜oxyquinolate, 硫酸铜, 树脂酸铜盐(copper tallate)和波尔多杀菌剂, 霜脍氟, 环唑醇, 嘧菌环胺, 双乙氧咪唑威(debacarb), 二-2-吡啶基二硫化物 1,1'-二氧化物, 苯氟磺胺, 哒菌清, 氯硝胺, 乙霉威, 噁醚唑, 双苯唑快, 氟嘧菌胺, 0,0-二异丙基-S-苄基硫代磷酸酯, dimefluazole, dimetconazole, 烯酰吗啉, 二甲嘧酚, 烯唑醇, 二硝巴豆鼓酯, 二噻农, 十二烷基二甲氯化铵, 十二环吗啉, 多果定(dodine), 多果定(doguadine), 克瘟散, 氟环唑, 乙嘧酚, (Z)-N-苄基-N([甲基(甲基-硫代乙叉基氨基氧基羰基)氨基]硫基)- β -氨基丙酸乙基酯, 土菌灵, 噁唑菌酮, 咪唑菌酮(RPA407213), 氯苯嘧啶醇, 腈苯唑(fenbuconazole), 甲呋酰苯胺, 环酰菌胺(KBR2738), 拌种咯, 苯锈啶, 丁苯吗啉, 毒菌锡, 毒菌锡, 福美铁, 嘧菌踪, 氟啶胺, 咯菌腈, 氟酰菌胺, 氟亚胺(fluoroimide), 氟喹唑, 氟硅唑, 氟酰胺, 粉唑醇, 灭菌丹, 麦穗宁, 呋霜灵, 呋吡菌胺, 谷种定, 己唑醇, 噁霉灵(hydroxyisoxazole), 噁霉灵(hymexazole), 抑霉唑, 酰胺唑, 双胍辛胺(iminoctadine), 双胍辛胺三乙酸酯(iminoctadine triacetate), 种菌唑, 异稻瘟净, 异菌脲, 异丙菌胺(SZX0722), 丁基

氨基甲酸 isopropanyl 酯, 稻瘟灵, 春雷霉素, 醚菌酯, LY186054, LY211795, LY248908, 代森锰锌, 代森锰, mefenoxam, 嘧菌胺, 灭锈胺, 甲霜灵, 叶菌唑, 代森联, 代森联-锌 (metiram-zinc), 苯氧菌胺, 腈菌唑, 甲基肿酸铁铵 (neoasozin), 福美镍, 间硝酞异丙酯, 氟苯嘧啶醇, 甲咪酰胺, 有机汞化合物, 噁霜灵, 环氧嘧磺隆, 喹菌酮, 恶咪唑, 氧化萎锈灵, 稻瘟酯, 戊菌唑, 戊菌隆, 叶枯净, phosetyl-Al, 亚磷酸, 四氯苯酞, picoxystrobin (ZA1963), 多氧霉素, 代森联, 烯丙异噻唑, 咪鲜安, 腐霉利, 丙酰胺, 丙环唑, 丙森锌, 丙酸, 吡啶磷, 啉斑肟, 嘧霉胺, 咯嗪酮, 氯吡啶醚, 吡咯尼林 (pyrrolnitrin), quaternary 铵基化合物, 灭螨猛, 苯氧喹啉, 五氯硝基苯, 硅氟唑 (F-155), 五氯酚钠, 螺环菌胺, 链霉素, 硫黄, 戊唑醇, 叶枯酞, 四氯硝基苯, 氟醚唑, 噻菌灵, thifluzamid, 2-(硫氟基甲基硫基) 苯并噻唑, 甲基硫菌灵, 福美双, timibenconazole, 甲基立枯磷, 甲苯氟磺胺, 三唑酮, 三唑醇, 叶锈特 (triazbutil), 唑菌嗪, 三环唑, 十三吗啉, 肟菌酯 (CGA279202), 噻菌灵, 氟菌唑, 灭菌唑, 稻纹散, 威百亩, 乙烯菌核利, 代森锌和福美锌。

结构式 (I) 的化合物可以与土壤、泥炭或其它的根围介质进行混合而用于保护植物以抵抗种子携带的、土壤包含的或叶子出现的真菌病。

用于该组合物中的合适的增效剂的例子包括增效醚 335, 增效散, 丙基增效散 (safroxan) 和十二烷基咪唑。

包含在该组合物中的合适的除草剂和植物生长调节剂将取决于预定目标和所需的效果。

可包括的水稻选择性除草剂的例子是敌稗。用于棉花的植物生长调节剂的例子是 PIX™。

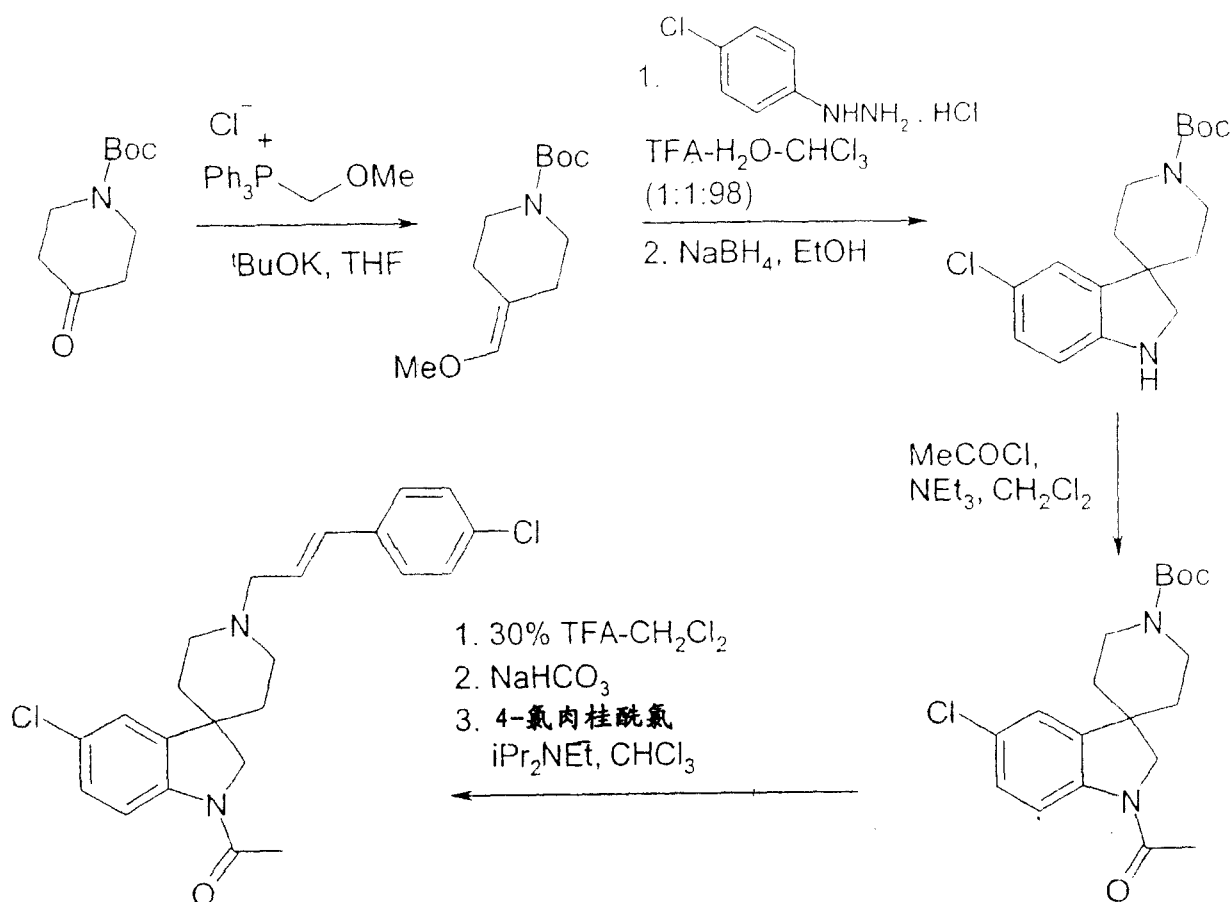
一些混合物可包括活性成分, 它们具有显著不同的物理、化学或生物学特性, 使得它们不容易适用于相同的普通配制料类型。在这些情况下可以制备其它的配制料类型。例如, 当一种活性成分是水不溶性固体和另一种是水不溶性液体, 则仍然有可能通过将固体活性成分分散为悬浮液 (使用与 SC 的制备方法类似的制备方法) 但将液体活性成分分散为乳液 (使用与 EW 的制备方法类似的制备方法), 将各活性成

分分散在同一连续水相中。所形成的组合物是悬浮-乳液(SE)配制料。

本发明由下列实施例来说明：

实施例 1

本实施例举例说明了化合物 V - 22, 1-乙酰基-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备



步骤 1: 4-甲氧基亚甲基哌啶-1-羧酸叔丁基酯的制备

在 4°C 和氮气气氛下，将叔丁醇钾 (21.3 g) 按份加入到氯化甲氧基甲基三苯基磷翁 (65.3 g) 在无水 THF (500 mL) 中的搅拌溶液中。记录到了鲜橙色，反应照这样保持 1 小时。慢慢地添加 4-氧代

哌啶-1-羧酸叔丁基酯 1 (25 g), 不让温度上升至超过 10°C, 然后将该混合物在室温下加热一整夜。

将反应混合物倒入水 (150 mL) 中, 用乙酸乙酯 (100 mL) 萃取三次, 合并的有机物用盐水 (300 mL) 洗涤, 用无水硫酸钠干燥和在真空中浓缩, 获得了棕色油 (50 g)。急骤层析法 [SiO₂; 己烷, 然后乙酸乙酯-己烷 (10: 90)] 获得了 26.4 g (77%) 的所想要的烯醇醚。

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 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-^t丁烯+H⁺)

步骤 2: 5-氯螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]-1'-羧酸叔丁基酯的制备

在 4°C 和氮气气氛下, 将三氟乙酸 (12 mL) 加入到 4-甲氧基亚甲基-哌啶-1-羧酸叔丁基酯 (12.5 g), 4-氯苯基盐酸胍 (9.75 g) 和乙醇 (1 mL) 在氯仿 (1200 mL) 中的搅拌溶液中。

混合物然后在 50°C 下搅拌过夜, 变成暗绿色。反应物用在冰水 (500 mL) 中的浓氨溶液 (200 mL) 骤冷, 有机物层变成橙色。分离有机物层, 含水层用二氯甲烷进一步萃取两次。合并有机物用盐水 (300 mL) 洗涤, 用无水硫酸钠干燥和真空浓缩, 获得 13g 粗亚胺 5-氯螺[3H-吲哚-3,4'-哌啶]-1'-羧酸叔丁基酯 (纯度大约 80%, 根据 NMR)。

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-^t丁烯+H⁺), 221/223 (M-Boc+H⁺).

在氮气气氛下, 将硼氢化钠 (6.0 g) 加入到粗亚胺 (12g) 在无水乙醇 (500 mL) 中的搅拌溶液中。将反应物搅拌 15 分钟, 再留置过夜。混合物进行真空浓缩, 残留物再溶于二氯甲烷 (100 mL)。该有机物用水 (100 mL) 和盐水 (100 mL) 洗涤, 用无水硫酸钠干燥和真空浓缩, 获得棕色固体。

急骤层析法 [SiO₂; 乙酸乙酯-己烷-三乙胺 (25: 75: 1)] 获得了 9.8 g (56%, 两个步骤) 的所想要的二氢吲哚。

M.p. 165-166 °C. $^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) 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 ($\text{M}+\text{H}^+$), 267/269 ($\text{M}-1\text{丁烯}+\text{H}^+$) 223/225 ($\text{M}-\text{Boc}+\text{H}^+$).

步骤 3: 1-乙酰基-5-氯螺[二氢吲哚-3, 4'-哌啶]-1'-羧酸叔丁基酯的制备

在氮气气氛下, 将乙酰氯 (2.8 mL) 滴加到 5-氯螺[二氢吲哚-3, 4'-哌啶]-1'-羧酸叔丁基酯 (9.8 g) 和三乙胺 (15 mL) 在无二氯甲烷 (400 mL) 中的搅拌溶液中。将反应物搅拌 1 小时, 然后用饱和碳酸氢钠溶液 (200 mL) 骤冷。有机层用无水硫酸钠干燥和真空浓缩, 获得 9.8 g (87%) 的呈灰白色的固体的所需酰胺。M. p. 64-66 °C. $^1\text{H NMR}$ (400

MHz, CDCl_3) 旋转异构体的 6:1 混合物. 主要的旋转异构体 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, $J = 7 \& 1\text{Hz}$, 1H), 8.15 (d, $J = 7\text{Hz}$, 1H). 次要的旋转异构体 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, $J = 7 \& 1\text{Hz}$, 1H), 7.48 (d, $J = 7\text{Hz}$, 1H).

步骤 4: 1-乙酰基-5-氯螺[二氢吲哚-3, 4'-哌啶]的制备

在氮气气氛下, 将三氟乙酸 (25 mL) 加入到 1-乙酰基-5-氯螺[二氢吲哚-3, 4'-哌啶]-1'-羧酸叔丁基酯 (8 g) 在无二氯甲烷 (250 mL) 中的搅拌溶液中。反应照这样保持 3 小时。反应物用饱和碳酸氢钠溶液 (200 mL) 洗涤, 用硫酸钠干燥和真空浓缩, 获得了灰白色固体。急骤层析法 [SiO_2 : 甲醇-二氯甲烷-三乙胺 (90: 5: 5)] 获得了 5.6 g (61%) 的所想要的 1-乙酰基-5-氯螺[二氢吲哚-3, 4'-哌啶]。

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) 旋转异构体的 6:1 混合物. 主要的旋转异构体 1.70 (m, 2H), 1.80 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 2.75 (t, $J = 12\text{Hz}$, 2H), 3.15 (m, 2H), 3.90 (s, 2H), 7.12 (d, $J = 1\text{Hz}$, 1H), 7.18 (dd, $J = 7 \& 1\text{Hz}$, 1H), 8.15 (d, $J = 7\text{Hz}$, 1H). 次要的旋转异构体 (部分数据) 2.44 (s, 3H), 2.86 (m, 2H), 3.10 (m, 2H), 4.05 (s, 2H). MS (ES+) 265/267 ($\text{M}+\text{H}^+$).

步骤 5: 1-乙酰基-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备

在室温和氮气气氛下将 4-氯肉桂酰氯 (4.0 g) 在氯仿 (120 mL) 中的溶液慢慢地加入到 1-乙酰基-5-氯螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶] (5.3 g) 和二异丙基乙胺 (6.7 mL) 在氯仿 (120 mL) 中的搅拌混合物中。该反应被加热至 50°C 保持 30h。反应混合物进行真空浓缩, 获得了红色油。急骤层析法 [SiO₂; 乙酸乙酯-己烷-三乙胺 (50:50:1)] 获得了 5.1 g (68%) 的所想要的化合物。¹H NMR (400 MHz, CDCl₃)

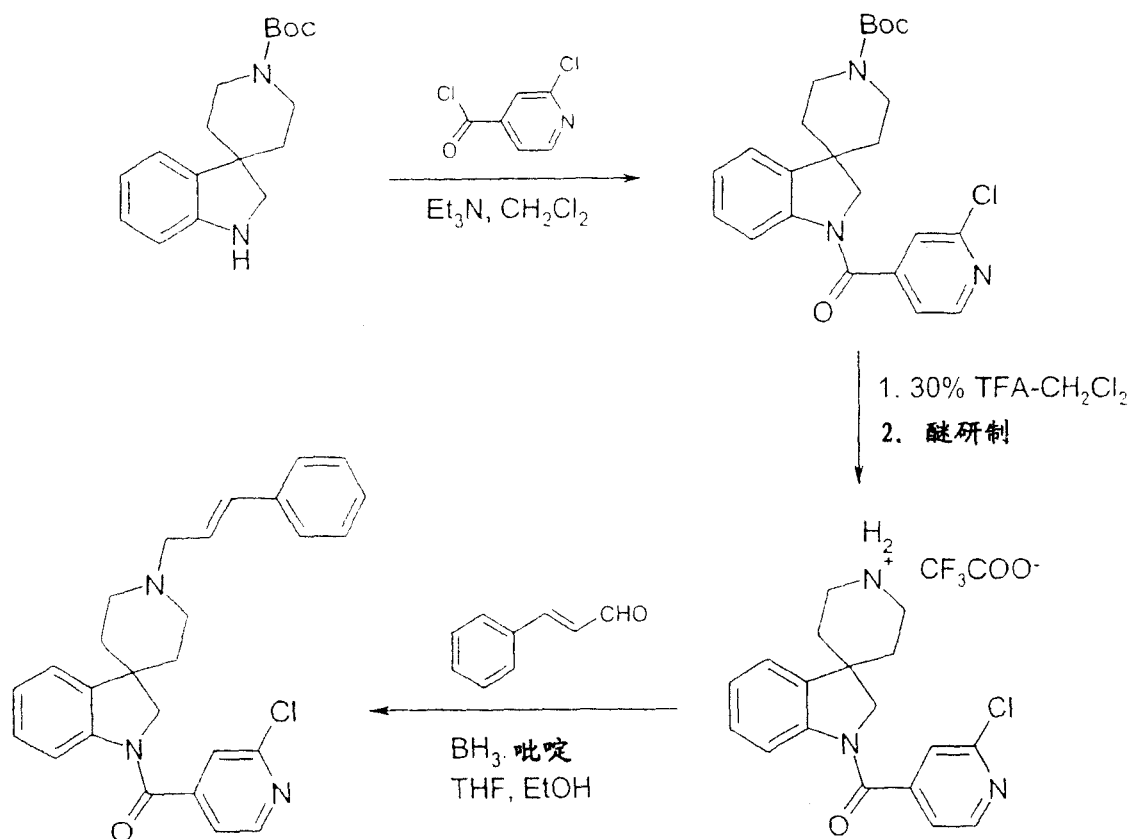
旋转异构体的 5:1 混合物. 主要的旋转异构体 1.70 (d, J = 12Hz, 2H), 2.0 (td, J = 12 & 2 Hz), 2.08 (t, J = 12 Hz, 2H), 2.25 (s, 3H), 3.03 (d, J = 12Hz, 2H), 3.20 (d, J = 7Hz, 2H), 3.96 (s, 2H), 6.28 (dt, J = 12 & 5Hz, 1H), 6.50 (d, J = 12Hz, 1H), 7.13 (d, J = 1Hz, 1H), 7.18 (dd, J = 7 & 1Hz, 1H), 7.3 (m, 4H), 8.15 (d, J = 7Hz, 1H). 次要的旋转异构体 (部分数据) 2.42 (s, 3H), 4.00 (s, 2H). MS (ES+) 415/417/419 (M+H⁺).

化合物 II-301, V-21, XXIX-49, V-192, V-62, V-202 XXX-1, XXX-11, XXX1-1, XXX-118, 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 和 XXXII-9

按照与在实施例 1 中所述的那些类似的方法来制备。

实施例 2

本实施例举例说明了化合物 I-1, 1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-1'-[反式-3-苯基烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备。



按照与在实施例 1 的步骤 1 和 2 中所述类似的方法，制备螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]-1'-羧酸叔丁基酯。

步骤 1: 1-(2-氯吡啶-4-基)羧基螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]-1'-羧酸叔丁基酯

在室温下，将亚硫酸氯(20 mL)加入到 2-氯异烟酸(1.2 g)中。添加 DMF (2 点滴)，再将混合物加热至回流，并保持 1 小时。蒸发过量亚硫酸氯，残留物再溶于二氯甲烷(50 mL)。添加三乙胺(2 mL)，随后滴加溶于二氯甲烷(20 mL)的螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]-1'-羧酸叔丁基酯(1.7 g)的溶液。

将该混合物搅拌 48 小时。反应混合物用 pH 9.4 缓冲液(100 mL)洗涤，含水层用二氯甲烷萃取。合并有机层进行干燥(硫酸镁)，过滤和蒸发。该粗产物用色谱法[SiO₂; 乙酸乙酯-己烷-三乙胺(50:50:1)，极性增加到(100:0:1)]提纯，获得 2.4 g (94%)的所需

酰胺。

M.p. 212 °C; ¹H NMR (400 MHz, d₆-DMSO) 1.50 (s, 9H), 1.6-1.8 (m, 4H), 2.8 (br s, 2H), 3.9 (br s, 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⁺- 异丁烯)。

步骤 2: 1- (2-氯吡啶-4-基)羧基螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]三氟乙酸盐的制备

将三氟乙酸 (30 mL) 加入到 1- (2-氯吡啶-4-基)羧基螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]-1'-羧酸叔丁基酯 (2.3 g) 在无二氯甲烷 (50 mL) 中的溶液中, 溶液在添加之后变黑。反应照这样保持 15 分钟小时。反应混合物进行真空蒸发, 深色残留物再悬浮在干醚 (100 mL) 中。研制残留物, 直到它变成自由流动的淡棕色沉淀物为止。通过过滤收集沉淀物并在氮气流中干燥, 获得了 2.28 g (96%) 的所需胺盐。

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 = 8Hz, 1H), 7.56 (d, J = 7Hz, 1H), 7.62 (s, 1H), 8.1 (br s, 1H), 8.56 (d, J = 7Hz, 1H), 8.8 (br s, 2H). MS (ES+) 328/330 (M+H⁺).

步骤 3: 1- (2-氯吡啶-4-基)羧基-1'- [反式-3-苯基烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备

将 1- (2-氯吡啶-4-基)羧基螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]三氟乙酸盐 (0.44 g) 和反式肉桂醛 (0.29 g) 悬浮于四氢呋喃 (8 mL) 和乙醇 (6 mL) 中。添加硼烷-吡啶络合物 (0.26 mL), 再将反应物在室温下强烈搅拌一整夜。蒸发混合物, 再在二氯甲烷和水之间分配。有机物用无水硫酸镁干燥, 以及在真空中蒸发。急骤层析法 [SiO₂; 乙酸乙酯-己烷-三乙胺 (25: 75: 1), 极性增加到 (50: 50: 1)] 获得了 0.42 g (94%) 的所需产物。

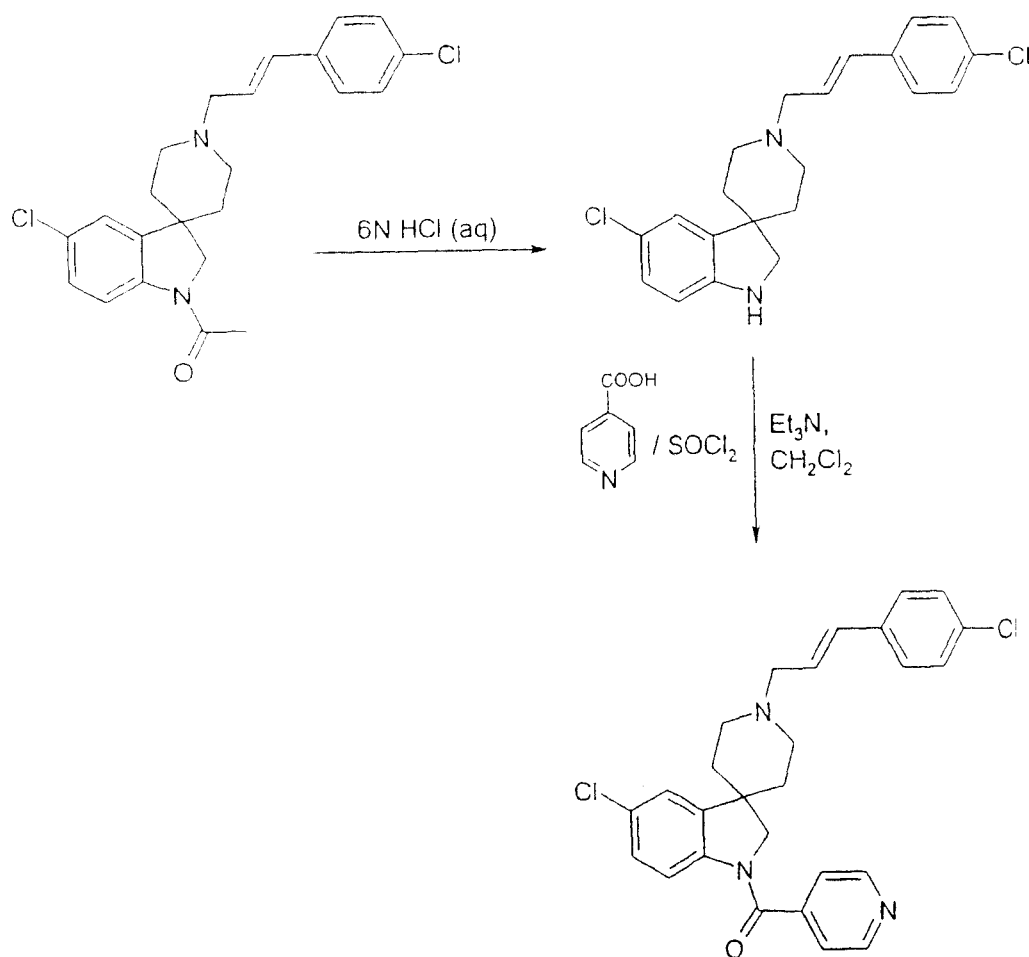
¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 旋转异构体的 3: 1 混合物。主要的旋转异构体 1.70 (m, 2H), 1.8-2.1 (m, 4H), 3.0 (m, 2H), 3.20 (m, 2H),

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 (br m, 1H), 8.6 (m, 1H)。MS (ES+) 444/446 ($M+H^+$)。

化合物 I-5, I-4, XXIX-7, XXIX-13, I-182, I-142, I-132, XXII-22, VI-1, VI-101, I-22, XXX-96, XXIX-31 (具有作为最终步骤的烷基化), XXIX-37 (具有作为最终步骤的烷基化), XXIX-43 (具有作为最终步骤的烷基化), XXVII-1 (随后用 HCl 在醚中处理), XXVII-2 (随后用 HCl 在醚中处理), XXVII-22 (随后用 HCl 在醚中处理), XXVI-1 (随后用过氧化氢在甲醇中处理) 和 XXIX-25 (具有作为最终步骤的酰化) 按照与在实施例 2 中所述的那些类似的方法来制备。

实施例 3

本实施例举例说明了化合物 VI-22, 1-(吡啶-4-基)-羰基-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3, 4'-哌啶]的制备。



按照在实施例 1 中所述的方法制备 1-乙酰基-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]。

步骤 1: 5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备

将 1-乙酰基-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶] (5.0 g) 溶于 6 N 氢氟酸 (100 mL) 和在回流下加热 3 小时。将混合物冷却, 含水层用固体 NaOH 粒料碱化 (小心

放热!)至 pH12, 再添加三乙胺(20 mL)。混合物用氯仿萃取三次。有机层用无水硫酸钠干燥, 过滤和在真空中蒸发, 获得了粗棕色油, 再用柱色谱法(SiO_2 , 乙酸乙酯: 己烷: 三乙胺, 1: 1: 0.01)提纯, 得到了 3.94 g (88%)的所需的二氢吲哚。MS (ES+) 373/375/377 ($\text{M}+\text{H}^+$)。

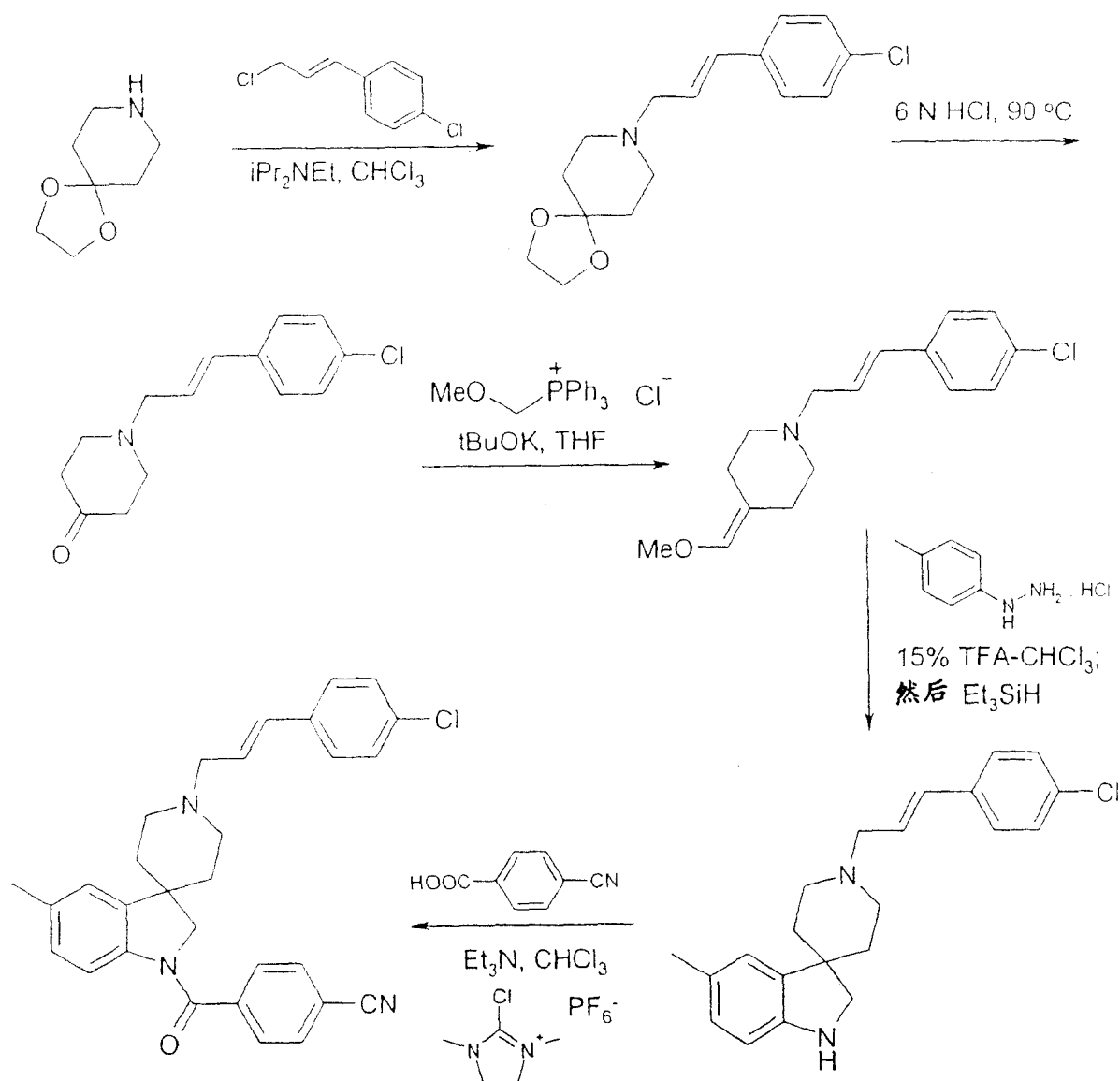
步骤 2: 1-(吡啶-4-基)羧基-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备

将异烟酸(0.022 g)和 DMF (1滴)溶于亚硫酸氯(2 mL), 再将混合物加热至回流, 并保持 1 小时。使混合物冷却, 以及在真空中蒸发掉过量亚硫酸氯。将残留物溶于氯仿(4 mL), 再添加三乙胺(0.1 mL)。添加 5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶](0.055 g)在氯仿(1 mL)中的溶液, 再将反应物在室温下搅拌 18 小时。添加碳酸钠水溶液(1M, 20 mL), 混合物在氯仿(3 x 20 mL)中萃取。合并有机层进行干燥(硫酸镁), 过滤和在真空中蒸发, 获得粗棕色油, 再通过色谱法(SiO_2 , 乙酸乙酯: 己烷: 三乙胺 0: 1: 0.01 到 1: 0: 0.01)提纯, 得到 0.034 g (49%)的所需酰胺。MS (ES+) 478/480/482 ($\text{M}+\text{H}^+$)。

化合物 XXV - 62, I - 192, I - 202, XXIX - 189, VI - 202 和 VI - 62 按照与在实施例 3 中所述那些类似的方法来制备。

实施例 4

本实施例举例说明了化合物 XIX-202, 1-(4-氯苯基甲酰基)-5-甲基-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备。



步骤 1: 8 - [反式-3- (4-氯苯基) 烯丙基] - 1,4 -二氧杂- 8 -氮杂螺[4.5]癸烷的制备

将 1,4 -二氧杂- 8 -氮杂螺[4.5]癸烷 (0.88 g) 溶于氯仿 (5 mL) , 再添加二异丙基乙胺 (2.1 mL) 。添加 4-氯肉桂酰氯 (1.2 g) 溶于氯仿 (2 mL) 的溶液, 将混合物加热至 70℃, 并保持一整夜。在真空中蒸发溶剂, 急骤层析法 [SiO₂; 乙酸乙酯-己烷-三乙胺 (50: 50: 2)] 获得了 1.38 g (76%) 的呈黄色油的所需酮缩醇。

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⁺.

步骤 2: 1- [反式 3- (4-氯苯基) 烯丙基] - 4-氧代哌啶的制备

将 8 - [反式-3- (4-氯苯基) 烯丙基] - 1,4 -二氧杂- 8 -氮杂螺[4.5]癸烷 (1.38 g) 溶于甲醇 (40 mL), 再添加 6 N 氢氯酸 (120 mL)。将该混合物在回流下加热 4 小时。冷却混合物并用固体氢氧化钠粒料碱化到 pH 14 (小心放热), 溶液变得不透明。水相用醚萃取三次。有机相用盐水洗涤, 用无水 MgSO₄ 干燥和蒸发, 获得 1.17g (100%) 的所需酮。

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 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⁺.

步骤 3: 1- [反式 3- (4-氯苯基) 烯丙基] - 4-甲氧基亚甲基哌啶的制备

氯化甲氧基甲基三苯基磷翁 (2.4 g) 溶于四氢呋喃 (20 mL), 并冷却到 4°C。添加叔丁醇钾 (0.78 g), 这使溶液变成鲜橙色。反应照这样保持 30 分钟。添加 1- [反式-3- (4-氯苯基) 烯丙基] - 4-氧代哌啶 (0.85 g) 溶于四氢呋喃 (10 mL) 的溶液, 再将混合物搅拌 10 分钟。在真空中蒸发掉溶剂, 残留物再悬浮于醚中。有机物用水洗, 再用无水硫酸镁干燥。急骤层析法 [SiO₂; 乙酸乙酯-己烷-三乙胺 (50:50:2)] 获得了 0.85 g (89%) 的所想要的烯醇醚。

¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 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⁺).

步骤 4: 5-甲基- 1' - [反式-3- (4-氯苯基) 烯丙基] 螺[二氢吡啶- 3,4' -哌啶]的制备

将三氟乙酸 (0.75 mL) 加入到 1- [反式-3- (4-氯苯基) 烯丙基] - 4-甲氧基亚甲基哌啶和 4-甲苯胍盐酸盐 (28 mg) 在氯仿 (5 mL) 中的搅拌溶液中, 再将反应加热至 50°C, 并保持 5 小时。添加三乙基硅烷 (2 mL) 并将反应物在 50°C 下加热另外 5 小时。使混合物冷却, 并在浓氨溶液/冰碎片 (20 mL) 中骤冷。水相用氯仿萃取 2 次, 合并有机相用无水硫酸镁干燥和真空浓缩, 获得 0.04 g (63%) 的所需二氢吲哚。

$^1\text{H NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) 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 ($\text{M}+\text{H}^+$), 203 ($\text{M}-4$ -氯肉桂酰基 $+\text{H}^+$).

步骤 5: 1- (4-氯基苯甲酰基) - 5-甲基- 1' - [反式-3- (4-氯苯基) 烯丙基] 螺[二氢吲哚- 3, 4' -哌啶] 的制备

该步骤使用 Zymark XP2 合成化学自动装置完成。将 5-甲基- 1' - [反式-3- (4-氯苯基) 烯丙基] 螺[二氢吲哚- 3, 4' -哌啶] 的溶液 (2 mL 的通过将 1.43 g 该化合物溶解在 100 mL 的 THF 中所获得的溶液) 加入到自动装置管, 在真空中脱除溶剂。将 4-氯基苯甲酸 (28 mg) 称量到不同的自动装置管。将六氟磷酸 2-氯- 1, 3-二甲基- 2-咪唑翁的溶液 (2 mL 的通过将 4.80 g 的该化合物溶解在 180 mL 的氯仿中所获得的溶液) 和三乙胺的溶液 (2 mL 的通过将 8.68 mL 该化合物溶解在 250 mL 的氯仿中所获得的溶液) 加入到该酸中, 搅该管拌和留置 30 分钟。将 2 mL 等份的该酸溶液加入到含有干燥胺的管内。搅拌该管, 并静置一整夜反应混合物用 1M 碳酸钠水溶液洗涤, 再蒸发溶剂该粗混合物用连接 MS 的液相色谱法提纯, 获得所想要的酰胺, 2.9 mg. MS (ES+) 482/484 ($\text{M}+\text{H}^+$).

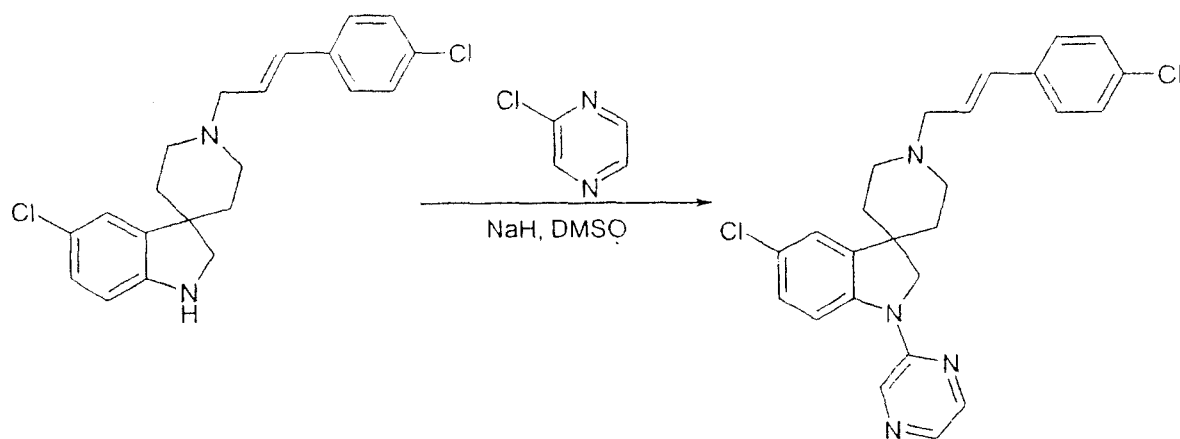
化合物 I-61, I-171, XXVIII-97, XIX-22, XXVIII-67, XXVIII-7, XX-22, XXIX-69, XXIX-75, XVIII-22, XXVIII-217, XXIX-81, XXIX-87, XV-22, XXIX-93, XXIX-99,

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 和 XXX-93

按照与在实施例 4 中所述的那些类似的方法来制备。

实施例 5

本实施例举例说明化合物 XIV - 22, 1-(2-吡嗪基)-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备。



按照在实施例 3 中所述的方法制备 5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]。

在氮气气氛下, 将氯化钠 (50 mg) 加入到 5-氯-1'-[反式-3-

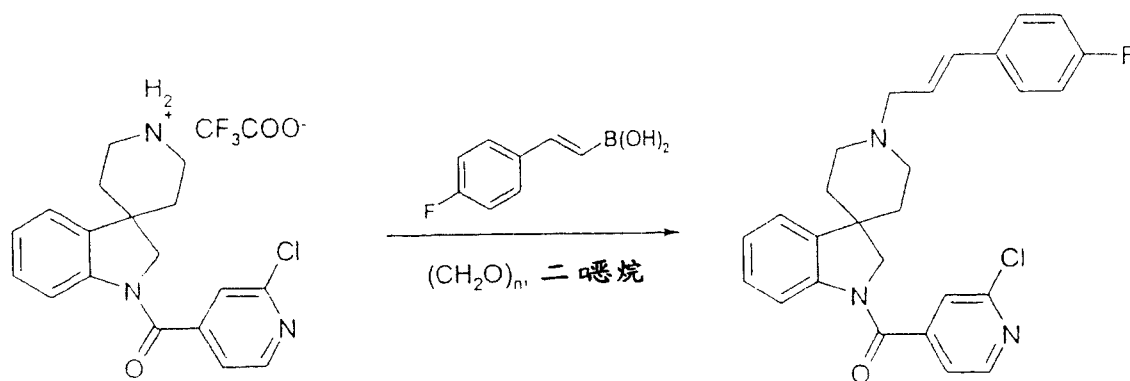
(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶] (35 mg) 和 2-氯吡嗪 (43 mg) 在无水 DMSO (5 mL) 中的搅拌溶液中。将反应物加热至 60°C, 并保持一整夜。反应混合物用盐水 (20 mL) 稀释和用二氯甲烷 (20 mL) 萃取四次。合并有机相用硫酸镁干燥和真空浓缩 (1 mmHg), 获得了棕色油。急骤层析法 [SiO₂, 乙酸乙酯-己烷-三乙胺梯度 (0: 98: 2) 到 (98: 0: 2)] 获得了 25 mg (55%) 的所需产物。

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 = 1Hz, 1H), 8.17 (d, J = 6 Hz, 1H), 8.25 (m, 2H). MS (ES+) 451/453/455 M+H⁺.

按照与在实施例 5 中所述的那些类似的方法制备化合物 XXIX-57 和 XXIX-63。

实施例 6

本实施例举例说明了化合物 XXII-3, 1-(2-氯吡啶-4-基)羧基-1'-[反式-3-(4-氟苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶] 的制备



按照在实施例 2 中所述的方法制备 1-(2-氯吡啶-4-基)羧基螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]三氟乙酸盐。

将 1-(2-氯吡啶-4-基)羧基螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]三氟乙酸盐 (0.25 g) 悬浮于二噁烷 (2 mL), 再添加多聚甲醛 (0.08 g)。搅拌混合物, 加热到 90°C, 并保持 20 分钟。将 2-(4-氟苯基) 乙烯

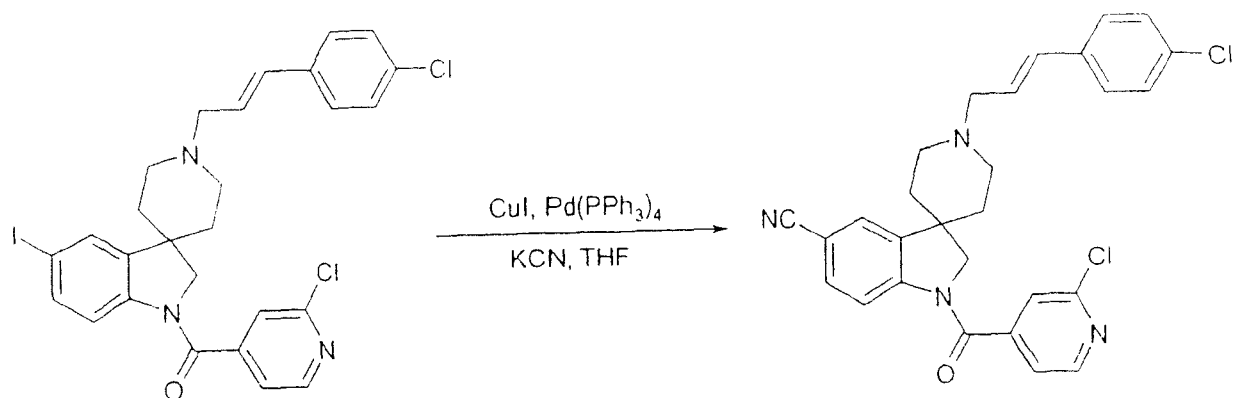
基硼酸 (0.10 g) 溶于二噁烷 (2 mL) 中, 所得溶液加入到盐/多聚甲醛混合物中, 所得混合物再加热至 90°C 并保持 24 小时。

将混合物冷却和在真空中蒸干。残留物在二氯甲烷和水之间分配, 以及有机层用碳酸钠水溶液 (1M) 洗涤和蒸发。粗产物用柱色谱法 (SiO_2 , 第一根柱子用二氯甲烷: 三乙胺 95: 5, 然后第二根柱子用纯二氯甲烷开始, 然后是从乙酸乙酯: 己烷: 三乙胺 25: 75: 1 到 95: 0: 5 的梯度) 提纯, 获得 0.20 g (76%) 的所需产物。MS (ES+) 462/464M+H⁺。

按照与在实施例 6 中所述的那些类似的方法制备化合物 I - 23, XXIX- 1, I - 21, I - 2, XXVI - 2 (之后用过氧化氢在甲醇中处理) 和 XXVI - 22 (之后用过氧化氢在甲醇中处理)。

实施例 7

本实施例举例说明了化合物 I- 212, 5-氟基-1- (2-氯吡啶-4-基) 羧基-1' - [反式-3- (4-氯苯基) 烯丙基] 螺[二氢吲哚-3, 4' - 哌啶] 的制备。



按照与在实施例 2 中所述的那些类似的方法制备 5-碘-1- (2-氯吡啶-4-基) 羧基-1' - [反式-3- (4-氯苯基) 烯丙基] 螺[二氢吲哚-3, 4' - 哌啶]。

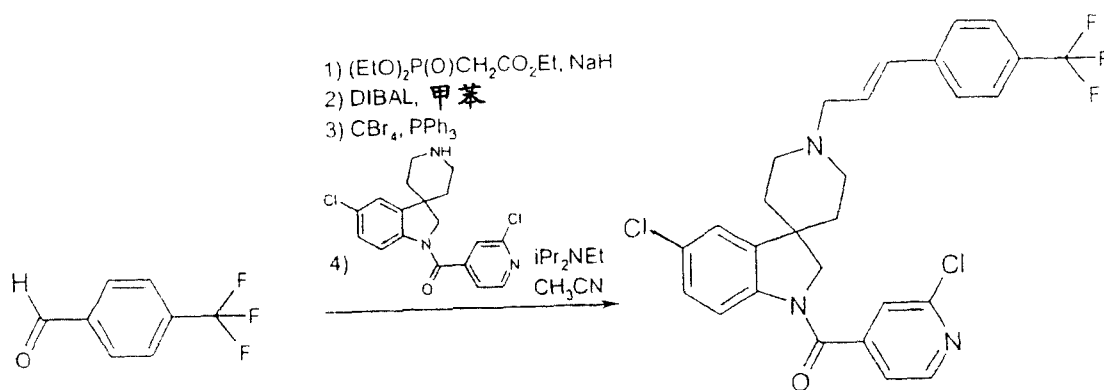
在干燥氮气氛围下, 将 5-碘-1- (2-氯吡啶-4-基) 羧基-1' - [反式-3- (4-氯苯基) 烯丙基] 螺[二氢吲哚-3, 4' - 哌啶] (0.05 g)

溶于无水 THF (5 mL)。添加氰化钾 (0.011 g) 和碘化铜(I) (0.016 g)，再将混合物脱气 15 分钟。添加四(三苯基磷)合钨 (0.005 g)，再将混合物加热至回流并保持 28 小时。反应混合物是用二氯甲烷 (50 mL) 稀释和用水 (30 mL) 洗。含水层用二氯甲烷 (2 x 40 mL) 萃取，合并有机层进行干燥(硫酸镁)，过滤和在真空中蒸发，获得了无色油，再通过制备色谱提纯。TLC (SiO₂, EtOAc: 己烷: Et₃N 1:1: 0.01) 获得了 0.041 g (95%) 的所需产物。MS (ES+) 503/505/507M+H⁺。

按照与在实施例 7 中所述的那些类似的标准方法制备化合物 XXIX-201, I-282, I-232。化合物 XXV - 222 通过用碳酸钾在甲醇中处理化合物 XXIX - 201 来制备。化合物 I - 222 通过在标准条件下再酰化化合物 XXV - 222 来制备。

实施例 8

本实施例举例说明了化合物 XXX - 51, 1 - (2-氯吡啶-4-基) 羧基-5-氟-1' - [(E) -3- (4-三氟甲基-苯基) 烯丙基] 螺[二氢吲哚 - 3, 4' - 吡啶] 的制备。



步骤 1: (E) -3- (4-三氟甲基-苯基) -丙烯酸乙酯的制备

在室温下，将在 1,2 -二甲氧基乙烷 (100 mL) 中的二乙基膦酸乙酸 乙基酯 (84 g) 滴加到氢氧化钠 (55%，在油中，15g) 在 1,2 -二甲氧基乙烷 (500 mL) 中的悬浮液中。然后添加溶于 1,2 -二甲氧基乙烷 (100ml) 的 4-三氟苯甲醛 (43.5 g)，所得混合物在室温下搅

拌 4 小时。反应通过添加水 (400 mL) 来骤冷, 用二乙醚 (700 mL) 稀释, 分离有机相, 用盐水洗涤, 用硫酸钠干燥和真空浓缩。该粗产物从己烷中再结晶出来, 获得 37g 的所需产物 (61%), 该产物通过质谱和 NMR 谱来表征。

步骤 2: (E)-3-(4-三氟甲基-苯基)-丙-2-烯-1-醇的制备

在 0°C, 向在步骤 1 中获得的酯 (37.1 g) 在甲苯 (310 mL) 中的溶液滴加氢化二异丁基铝 (1.2M 甲苯溶液, 317 mL) 和将溶液在 0°C 下搅拌 1 小时。在 0°C 小心地添加水 (47.6 mL), 随后添加氢氧化钠 2M (47.6 mL) 和最后添加水 (95.1 mL)。将混合物在室温下搅拌 1 小时。在过滤后, 溶液用氢氟酸 2N, 水和盐水洗涤, 用硫酸钠干燥和真空浓缩, 获得 29.5g 的呈固体的所需醇 (96%), 该醇用质谱和 NMR 谱来表征。

步骤 3: 1-((E)-3-溴-丙烯基)-4-三氟甲基-苯的制备

在室温下, 向在步骤 2 中获得的醇 (10 g) 在二甲基乙酰胺 (100 mL) 中的溶液添加三苯基膦 (23 g) 和四溴化碳 (29 g)。所得溶液在室温下搅拌 1 小时, 倒入水中并用乙酸乙酯萃取。有机相用水和盐水洗涤, 用硫酸钠干燥和用硅胶过滤, 获得 13g 的呈白色固体的所需产物 (95%), 该产物再通过质谱和 NMR 谱来表征。

步骤 4: 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[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备

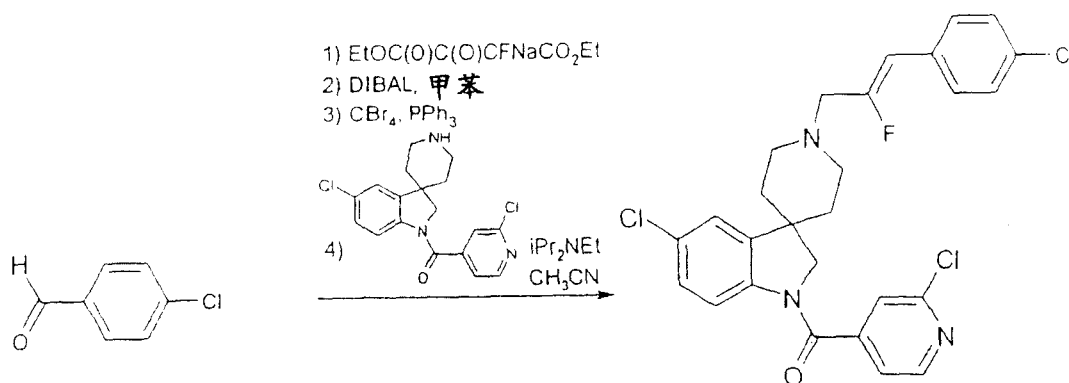
向 (2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氯-螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶] (20 g) 和二异丙基乙胺 (18.2 mL) 在乙腈 (200 mL) 中的搅拌悬浮液添加在步骤 3 中获得的烯丙基溴 (11.6 g) 和将反应混合物在室温下搅拌一整夜。溶液用乙酸乙酯 (200 mL) 稀释, 用盐水 (3x100 mL) 洗涤, 用硫酸钠干燥和真空浓缩。残留物通过柱色谱法 (SiO₂, 乙酸乙酯: 己烷: 三乙胺 95: 5: 0.1 到乙酸乙酯: 甲醇: 三乙胺 95: 5: 0.1) 提纯, 获得 18.9 g 的所需产物 (82%)。mp = 130°C。

化合物 XXX-82, XXX-83, XXX-84, XXX-85, XXX-86, XXX-87, XXX-91 和 XXX-92 按照与在实施例 8 中所述的那些类

似的标准方法来制备。

实施例 9

本实施例举例说明了化合物 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[二氢吲哚-3,4'-哌啶] 的制备。



步骤 1: (Z) -3- (4-氯-苯基) -2-氟-丙烯酸甲酯的制备

照 Cousseau, J. 等人, 四面体通讯 1993, 43, 6903 来推论, 在 0°C 下, 将 4-氯苯甲醛 (0.66 g) 加入到二乙基氟草乙酸钠盐 (1 g, 按照 Alberg 等人, J. Am. Chem. Soc. 1992, 3542 从草酸二乙酯, 氟乙酸乙酯和氢氧化钠制备) 在四氢呋喃 (20 mL) 中的悬浮液中, 所得混合物在 0°C 下搅拌 1 小时和然后在 80°C 下搅拌 3 小时。反应混合物进行真空浓缩, 用二乙醚稀释, 用碳酸氢钠水溶液, 水和盐水洗涤, 用硫酸钠干燥和真空浓缩到, 获得粗残留物 (1.2 g), 它直接在下一步中使用。

步骤 2: (Z) -3- (4-氯-苯基) -2-氟-丙-2-烯-1-醇的制备

步骤 3: 1- (Z) -3-溴-2-氟-烯丙基) -4-氯-苯的制备

步骤 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[二氢吲哚-3,4'-哌啶] 的制备

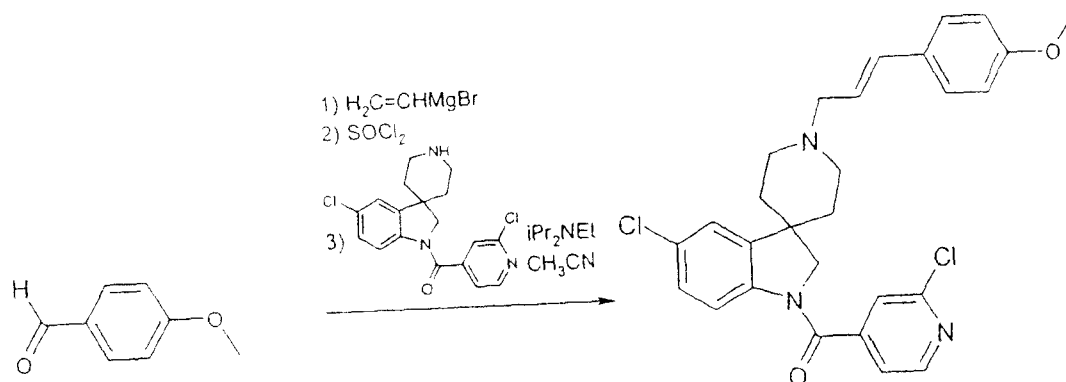
步骤 2 到 4 按照在实施例 8 中所述的工序进行, 步骤 2-4 获得了 0.17g 的所需产物 (41%), 该产物通过质谱和 NMR 谱来表征。MS (ES+) 530。

化合物 XXX - 114 按照与在实施例 9 中所述的那些类似的标准方

法来制备。

实施例 10

本实施例举例说明了 I - 25, 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[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备。



步骤 1: 1- (4-甲氧基-苯基) -丙-2-烯-1-醇的制备

在 -10°C 和氩气下, 向对甲氧基苯甲醛(1.54 mL)在四氢呋喃(20 mL)中的溶液滴加乙烯基溴化镁(1M, THF 溶液, 12.5 mL)。溶液在室温下搅拌一夜, 再通过添加饱和氯化铵水溶液(20 mL)来骤冷。分离有机相, 用硫酸钠干燥和真空浓缩。残留物通过柱色谱法(SiO_2 , 乙酸乙酯: 环己烷 7: 3)提纯, 获得了 1.05g 的呈无色油(51%)的所需产物, 该产物通过质谱和 NMR 谱来表征。

步骤 2: 1- ((E) -3-氯-丙烯基) -4-甲氧基-苯的制备

向在步骤 1 中获得的烯丙醇(200 mg)在二乙醚(3 mL)中的溶液添加亚硫酸氯(0.087 mL), 再将该溶液在室温下搅拌 1 小时。溶液真空浓缩, 获得了 221 mg 的作为无色固体的产物(100%)。Mp= 70°C 。

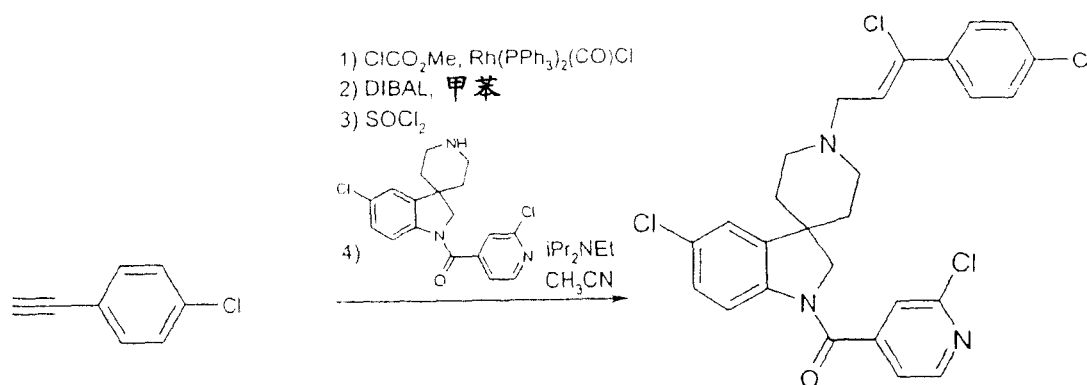
步骤 3: 1- (2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氯-1'- [反式-3- (4-甲氧基-苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备

按照在实施例 101, 步骤 4 中所述的方法进行 1- (2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氯-螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶](0.43 g)与在步骤 2

中获得的 1-((E)-3-氯-丙烯基)-4-甲氧基-苯(0.22 g)的烷基化, 获得 0.36 g 的标题化合物(59%), 该化合物通过质谱和 NMR 谱来表征。MS (ES+) 509。Mp = 83-85 °C。

实施例 11

本实施例举例说明了化合物 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[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备。



步骤 1: (Z)-3-氯-3-(4-氯-苯基)-丙烯酸甲酯的制备

照 Tanaka, M. 等人, J. Am. Chem. Soc. 1998, 120, 12365 来类推。

向 4-氯苯基乙炔(100 mg)和 Rh(CO)(PPh₃)₂Cl (5 mg)在甲苯(3 mL)中的溶液添加氯甲酸甲酯(0.17 mL), 再将混合物在密封管中在 110°C 下搅拌 10 小时。反应混合物进行真空浓缩和柱色谱分离(SiO₂, 乙酸乙酯: 环己烷 1: 9), 获得 104 mg 呈棕色固体的所需产物(61%), 该产物通过质谱和 NMR 谱来表征。Mp= 40°C。

步骤 2: (Z)-3-氯-3-(4-氯-苯基)-丙-2-烯-1-醇的制备

按照在实施例 8 的步骤 2 中所述的工序, 将 (Z)-3-氯-3-(4-氯-苯基)-丙烯酸甲酯(462 mg)转化为所需产物(391 mg, 96%), 该产物再通过质谱和 NMR 谱来表征。

步骤 3: 1-氯-4-((Z)-1,3-二氯-丙烯基)-苯的制备

向 (Z)-3-氯-3-(4-氯-苯基)-丙-2-烯-1-醇(101 mg)在甲苯(3 mL)中的溶液添加亚硫酸氯(0.11 mL)和一滴二甲基甲酰胺。在 1 小时以后, 溶液真空浓缩, 获得 120 mg 的呈无色油的所需烯丙

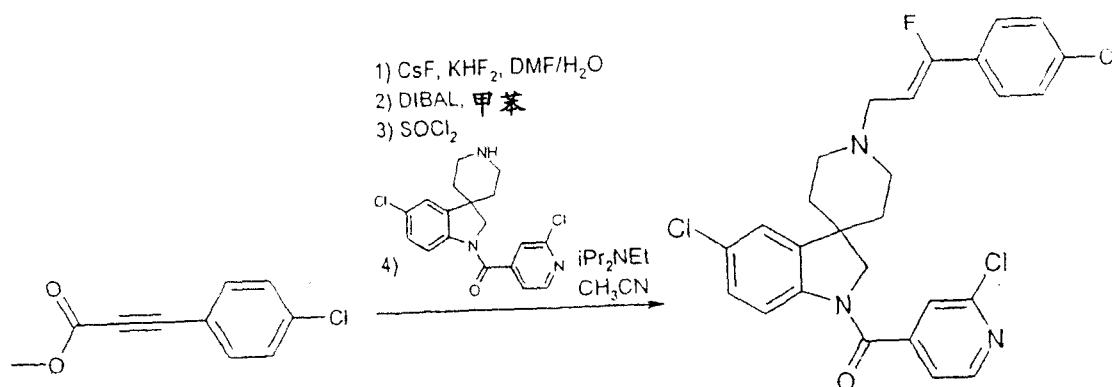
基氯(100%)。

步骤 4: 1-(2-氯吡啶-4-基)羧基-5-氯-1'-[(Z)-3-(4-氯苯基)-3-氯-烯丙基]螺[二氢吡啶-3,4'-哌啶]的制备

按照在实施例 101, 步骤 4 中所述的方法进行 1-(2-氯吡啶-4-基)羧基-5-氯-螺[二氢吡啶-3,4'-哌啶] (0.18 g) 与在步骤 3 中获得的 1-氯-4-((Z)-1,3-二氯-丙烯基)-苯 (0.11g) 的烷基化, 获得 0.17 g 的作为泡沫的标题化合物 (64%), 该化合物通过质谱和 NMR 谱来表征。MS (ES+) 548。

实施例 12

本实施例举例说明了化合物 XXX-90, 1-(2-氯吡啶-4-基)羧基-5-氯-1'-[(Z)-3-(4-氯苯基)-3-氯-烯丙基]螺[二氢吡啶-3,4'-哌啶]的制备。



步骤 1: (Z)-3-(4-氯-苯基)-3-氯-丙烯酸甲酯的制备

与 Cousseau, J. J. Chem. Soc. Chem. Commun. 1989, 1493 相类似, 向 (4-氯-苯基)-丙炔酸甲酯 (5.36 g) 在二甲基甲酰胺 (60 mL) 中的溶液添加氯化铯 (11.4 g) 和在水中 (5.4 mL) 的氟氢化钾 (2.73 g), 再将混合物在 80℃ 搅拌 8 小时。将反应混合物冷却到室温, 用乙酸乙酯 (50 mL) 稀释, 有机相用水 (3x50 mL) 和盐水 (3x20 mL) 洗涤, 用硫酸钠干燥和真空浓缩。残留物用柱色谱分离法 (SiO₂, 乙酸乙酯: 环己烷 1: 9) 提纯, 获得 1.06g 的所需产物 (20%), 该产物通过质谱和 NMR 谱来表征。

步骤 2: (Z)-3-(4-氯-苯基)-3-氟-丙-2-烯-1-醇的制备

步骤 3: 1-氯-4-((Z)-3-氟-1-氟-丙烯基)-苯的制备

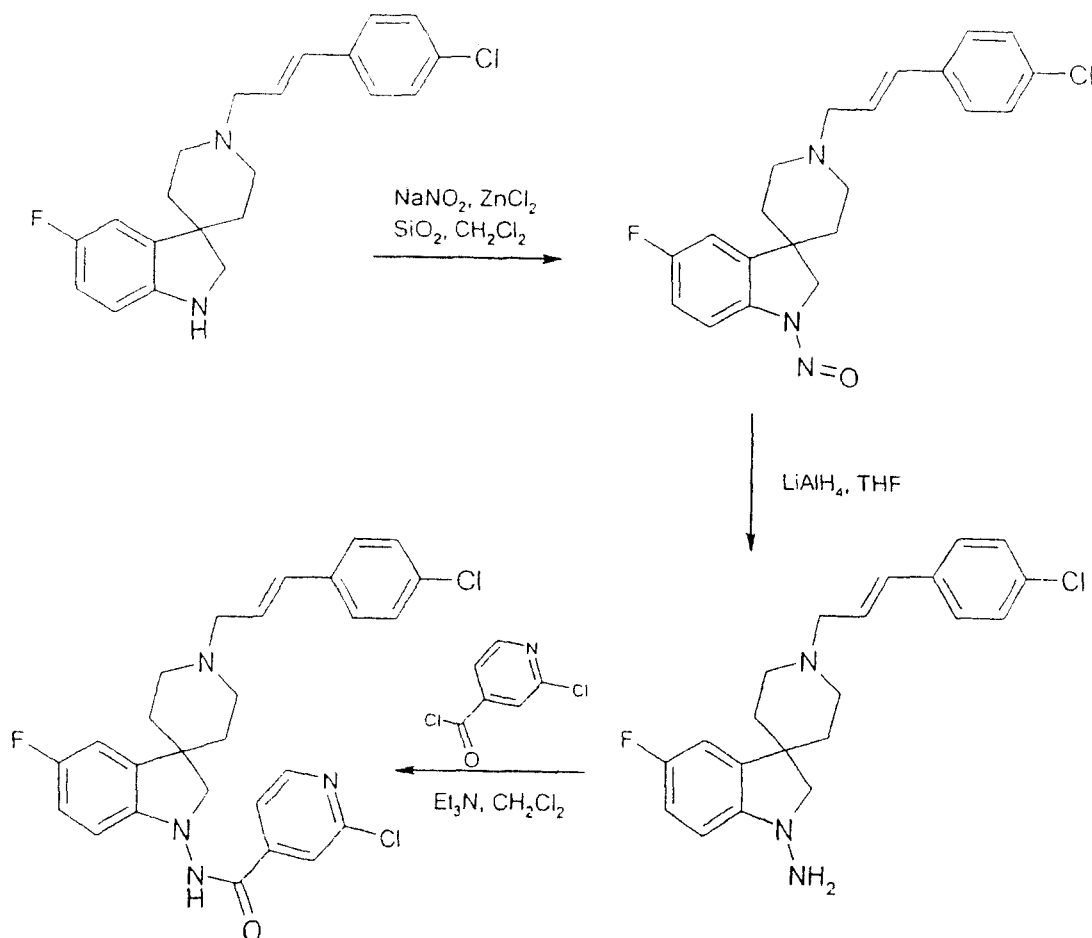
步骤 4: 1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氟-1'-[(Z)-3-(4-氯苯基)-3-氟-烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备

步骤 2 到 4 按照在实施例 11 中所述的方法进行, 步骤 2-4 获得了 163mg 的所需产物 (42%), 该产物通过质谱和 NMR 谱来表征。MS (ES+) 531。

化合物 XXX-88 和 XXX-90 按照与在实施例 12 中所述的那些类似的标准方法来制备。

实施例 13

本实施例举例说明了化合物 XXX-121 和 XXX-94, 1-羧酸(4-氯-苯基)-酰胺-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备。



5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]按照与在实施例4的步骤1-4中所述类似的方法来制备。

步骤1: 化合物XXX-121, 1-亚硝基-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备

将5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶] (5 g) 在二氯甲烷 (15 mL) 中的溶液加入到湿硅胶 (50%w/w, 在水中, 2.9 g) 和氯化锌 (5.73 g) 在二氯甲烷 (15 mL) 中的悬浮液中, 所得混合物在室温下搅拌 3.5 小时。反应混合物用乙酸乙酯稀释和该不溶残渣通过过滤除去。滤液用饱和碳酸氢钠溶液水, 水和盐水洗涤, 用硫酸钠干燥和在真空中蒸发溶剂, 获得 5.13 g (95%) 的作为固体的亚硝基-胺。MS (ES+) 386。

步骤2: 1-氨基-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备

在 0°C 下, 将 1-亚硝基-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶] (5 g) 在四氢呋喃 (60 mL) 中的溶液滴加到氢化铝锂 (1.47 g) 在四氢呋喃 (60 mL) 中的悬浮液中, 所得混合物在室温下搅拌 2.5 小时。小心地添加水 (4.8 mL), 随后添加 15% 氢氧化钠水溶液 (4.8 mL), 最后添加水 (14.4 mL)。将混合物搅拌 0.5 小时, 用乙酸乙酯稀释, 用硫酸钠干燥, 和过滤。在真空中蒸发溶剂, 获得 5.1 g (100%) 的作为固体的所需氨基-二氢吲哚。MS (ES+) 372。

步骤3: 1-羧酸(4-氯-苯基)-酰胺-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备。

在室温下, 将 2-氯代异烟酰氯 (1.2 g) 加入到 1-氨基-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶] (0.2 g) 和三乙胺 (0.3 mL) 在二氯甲烷 (4 mL) 中的搅拌溶液中。将混合物搅拌 2 小时。

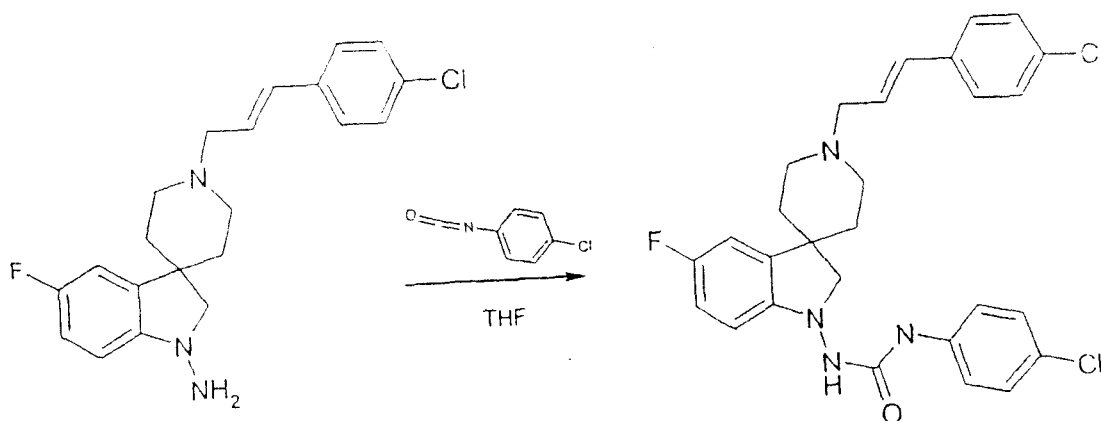
反应混合物用水洗涤和含水层用二氯甲烷萃取。合并有机层进行干燥(硫酸钠), 过滤和蒸发。粗产物通过色谱法 [SiO₂; 乙酸乙酯-甲

醇 (96: 4) 提纯, 获得 0.13 g (48%) 的所想要的产物。MS (ES+) 511。

按照与在实施例 13 中所述那些类似的标准方法制备化合物 XXX - 95, XXX - 97, XXX - 98 和 XXX - 99。

实施例 14

本实施例举例说明了化合物 XXX - 119, 1-(4-氯-苯基)-脲-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]的制备。

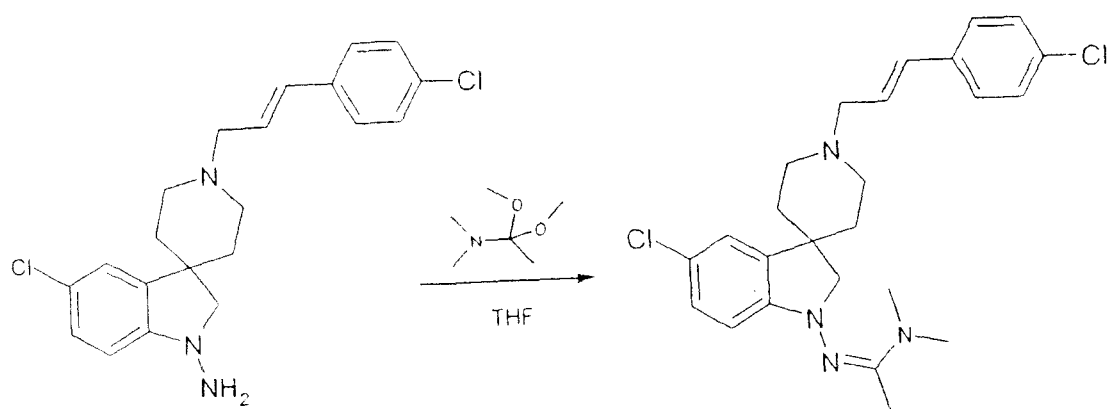


向 1-氨基-5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶] (0.2 g) 在四氢呋喃 (2ml) 中的溶液添加异氰酸 4-氯苯基酯 (70mg), 混合物在室温下搅拌 10 分钟。在真空中蒸发溶剂, 残留物用制备 HPLC 提纯, 获得作为固体的标题化合物 (49%)。MS (ES+) 525。

按照与在实施例 14 中所述那些类似的标准方法制备化合物 XXX - 100, XXX - 101, XXX - 102 和 XXX - 103。

实施例 15

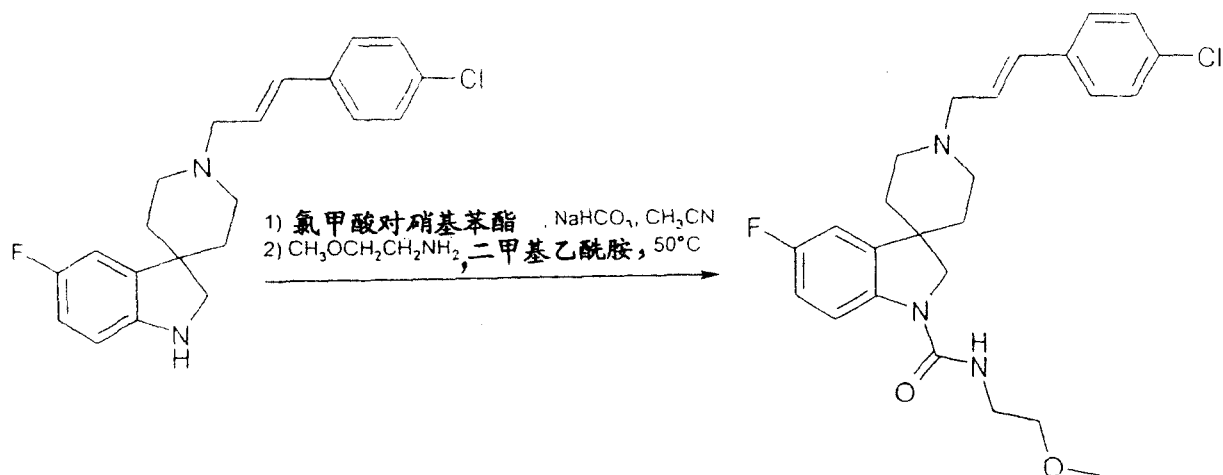
本实施例举例说明了化合物 XXX - 102, N'-[5-氟-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶]-1-基]-N,N-二甲基乙脒的制备。



向 1-氨基-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶] (0.15 g) 在四氢呋喃 (2 mL) 中的溶液添加 N,N-二甲基乙酰胺二甲基缩醛 (0.2 g), 混合物在 70°C 搅拌 24 小时。在真空中蒸发溶剂, 残留物用色谱法 [SiO₂; 乙酸乙酯-甲醇 (9:1)] 提纯, 获得 35 mg (20%) 的所想要的产物。MS (ES⁺) 457。

实施例 16

本实施例举例说明了化合物 XXX-105, 1-[羧酸(2-甲氧基-乙基)-酰胺]-5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-哌啶] 的制备。

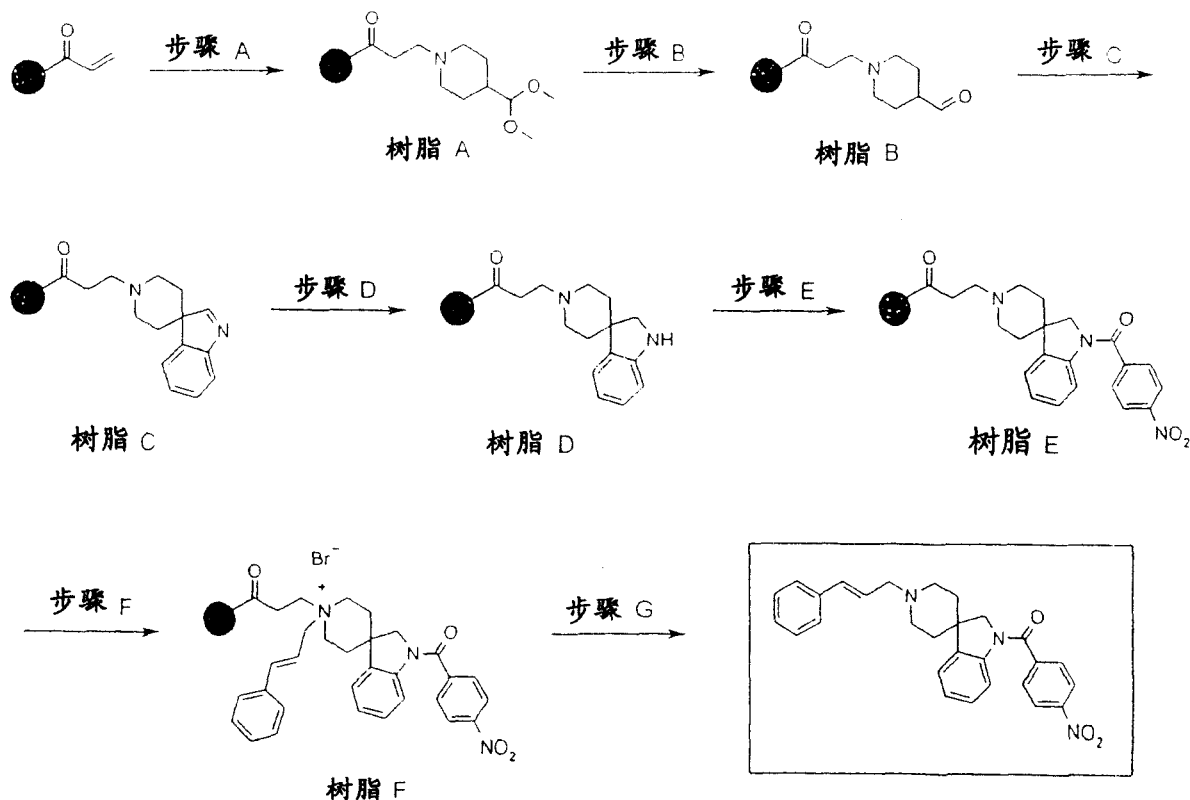


将 5-氯-1'-[反式-3-(4-氯苯基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-吡啶] (2.5 g) 加入到碳酸氢钠 (1.7 g) 在乙腈 (45 mL) 中的悬浮液中, 并将所得混合物冷却到 0°C。然后滴加 4-硝基苯基氯甲酸酯 (2.54 g), 所得溶液在 0°C 下搅拌 2 小时。将 3 mL 的溶液加入到 2-甲氧基-乙胺 (315 mg) 和三乙胺 (0.3 mL) 在二甲基甲酰胺 (10 mL) 中的溶液中, 所得混合物在 50°C 下搅拌 3 小时。将溶液冷却到室温, 倒入水中, 用乙酸乙酯萃取三次。有机相用硫酸钠干燥, 过滤, 以及在真空中脱除溶剂。残留物是用倒相 HPLC 提纯, 获得所需产物 (57% 产率)。MS (ES+) 458。

化合物 XXX-104, XXX-106, XXX-107, XXX-108, XXX-109, XXX-110, XXX-111 和 XXX-112 按照与在实施例 16 中所述那些类似的标准方法来制备。

实施例 17

化合物 XXVI-1, 1,2-二氢-1-(4-硝基苯甲酰基)-1'-(3-苯基-2-丙烯基)-螺[3H-吲哚-3,4'-吡啶] 的制备



1,2-二氢-1-(4-硝基苯甲酰基)
-1'-(3-苯基-2-丙烯基)
-螺[3H-吲哚-3,4'-吡啶]

在以下详细描述实验中，标准洗涤将是指下列洗涤顺序：二甲基甲酰胺，二氯甲烷，二甲基甲酰胺，二氯甲烷，甲醇，二氯甲烷，甲醇 (X2)，叔丁基甲基醚 (X2)，而树脂溶胀程序将以 10 mL 的溶剂/克的树脂的标准为基础。化合物的表征和纯度使用高效液相色谱法偶联的质谱分析法 (HPLC - MS) 和质子核磁共振 ($^1\text{H NMR}$) 对所选择的化合物测定。REM 树脂由市场上可买到的(羟甲基)聚苯乙烯树脂和丙烯酰氯制备。树脂的载量被假设为在整个合成过程中恒定在 1.2mmol g^{-1} 。

步骤 A: 4-甲酰基哌啶二甲基缩醛在 REM 树脂(树脂 A)上的加载
REM 树脂 (10 g, 12 mmol) 在二甲基甲酰胺 (100 mL) 中溶胀。然后添加 4-甲酰哌啶二甲基缩醛 (2.86 g, 18 mmol) 在二甲基甲酰胺 (10 mL) 中的溶液。将反应物在室温下摇动 18 小时。然后过滤所得树脂，按照标准工序洗涤和在真空中干燥，获得 11.83 g (96%产率) 的所想要的树脂 A。

步骤 B: 固体担载的 4-甲酰哌啶(树脂 B)的制备

将 100 mL 三氟乙酸/二氯甲烷/水 (49: 49: 2) 的溶液加入到树脂 A (10 g, 12 mmol) 中，混合物然后在室温下摇动 2 小时。

然后过滤所得树脂，使用二氯甲烷 (x3)，甲醇，二氯甲烷，甲醇，叔丁基甲基醚 (X2) 洗涤并在真空中干燥，获得 9.48g 的所想要的树脂 B，该树脂在 -50°C 在氮气下储藏。

步骤 C: 固体担载的螺 [3H -吡啶- 3, 4' -哌啶] (树脂 C) 的制备
向树脂 B (1 g, 1.2 mmol) 添加 5% 三氟乙酸在二氯甲烷 (10 mL) 中的溶液，随后添加茴香醚 (0.0026 g, 0.024mmol)。混合物用氮气脱气为 10 分钟，再添加苯肼 (0.39 g, 3.6 mmol)。反应混合物在氮气下搅拌和加热到回流并保持 36 小时。

然后过滤混合物，按照标准洗涤周期洗涤并在真空中干燥，获得 1.09g 的所想要的树脂 C，它立即在 D 中使用。

步骤 D: 固体担载的 1,2 -二氢-螺 [3H -吡啶- 3, 4' -哌啶] (树脂 D) 的制备

向在无水二氯甲烷 (10 mL) 中溶胀的树脂 C (1 g, 1.2 mmol)

添加作为固体的三乙酰氧基硼氢化钠(0.51 g, 2.4 mmol)。反应混合物在室温下在氮气下搅拌2小时。然后过滤树脂,按照标准洗涤周期洗涤并在真空中干燥,获得0.95g的所需树脂D,该树脂在-50℃在氮气下储藏。

步骤E: 固体负载的1,2-二氢-1-(4-硝基苯甲酰基)-螺[3H-吲哚-3,4'-哌啶](树脂E)的制备

树脂D(0.5 g, 0.6 mmol)在无水二氯甲烷(5 mL)中溶胀。向该混合物添加4-硝基苯甲酰氯(0.33 g, 1.8 mmol)和N,N-二异丙基乙胺(0.42 mL, 2.4 mmol)。在室温下摇动18小时以后,过滤树脂,按照该标准洗涤周期洗涤并在真空中干燥,获得0.53g的所想要的树脂E。

步骤F: 固体负载的1,2-二氢-1-(4-硝基苯甲酰基)-螺[3H-吲哚-3,4'-哌啶](树脂F)的季铵化反应

向在无水二甲基甲酰胺(1 mL)中的树脂E(0.1 g, 0.12 mmol)添加肉桂酰溴(0.12 g, 0.6 mmol)。将反应混合物在室温下摇动48小时。所得树脂然后按照标准洗涤周期洗涤,获得0.11g的所想要的树脂F,该树脂立即在步骤G中使用。

步骤G: 1,2-二氢-1-(4-硝基苯甲酰基)-1'-(3-苯基-2-丙烯基)-螺[3H-吲哚-3,4'-哌啶]的制备

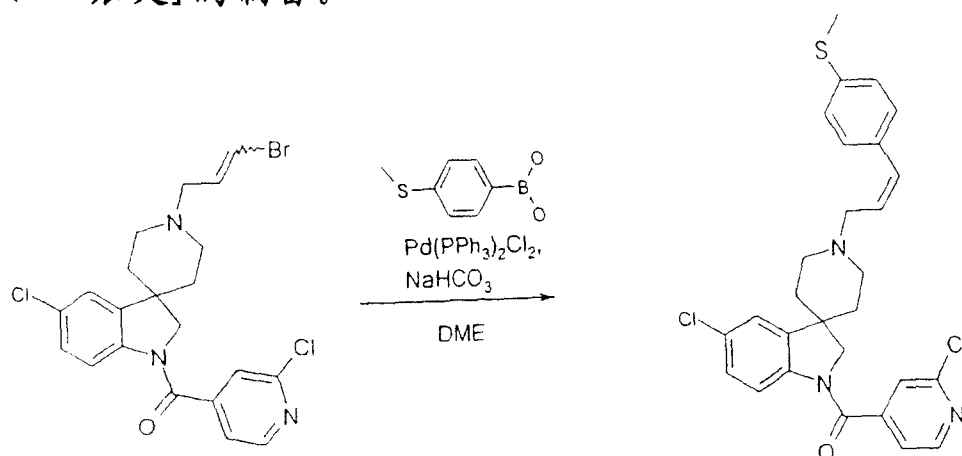
向在无水二甲基甲酰胺(1.1 mL)中的树脂F(0.11 g, 0.132 mmol)添加Amberlite IRA-93(预先用10% N,N-二异丙基乙胺/二甲基甲酰胺洗涤)(0.11 g)。混合物在室温下摇动36小时。然后收集二甲基甲酰胺滤液和在减压下浓缩。树脂进一步用二氯甲烷和甲醇洗涤。然后合并全部滤液并真空浓缩,获得0.052 g(88%产率)作为浅黄色油的所需化合物。

用类似的方法制备其他化合物,包括化合物XVI-21,5-氯-1,2-二氢-1-(4-硝基苯甲酰基)-1'-(3-苯基-2-丙烯基)-螺[3H-吲哚-3,4'-哌啶]。

实施例 18

本实施例举例说明了化合物XXX-72,1-(2-氯吡啶-4-基)羧

基-5-氯-1'-[(Z)-3-(4-甲基苯硫基)烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-吡啶]的制备。



向在“Zisser-block”中的 13.1 mg 4-硫甲基硼酸添加在 0.05ml 二甲氧基乙烷中的 14.5 mg 1-(2-氯吡啶-4-基)羰基-5-氯-1'-[(E/Z)-3-溴-烯丙基]螺[二氢吲哚-3,4'-吡啶]，在 0.3 mL H₂O 中的 8 mg 碳酸氢钠和 2 mg 二氯·双-(三苯基膦)合钯(II)。混合物在 75℃ 搅拌 13 小时。

分离有机物层和在真空中蒸发，残留物用色谱法(H₂O-乙腈梯度)提纯，获得所需产物。MS(ES+) 525。通过类似方法，制备其他化合物，包括化合物 XXX 1-4，

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 和 XXXI-7。

实施例 19

本实施例举例说明了结构式(I)的化合物的农药/杀昆虫的性能。生物测定试验如下进行：

棉贪夜蛾

将棉叶片置于在 24 孔微量滴定板中的琼脂上, 以 200 ppm 的施药量喷雾试验溶液。在干燥之后, 叶片用 5 只 L1 幼虫感染。在处理之后的第 3 天 (DAT) 就致死率、驱避效果、摄食行为、和生长调节检查样品。下面的化合物获得了对棉贪夜蛾的至少 80% 控制:

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, XXX1-4, 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, XXX1-1, XXX-110, XXX-111, XXX-31, XXX-51, XXX-66, XXX-86, XXX-93 和 XXXI-5.

烟芽夜蛾

虫卵 (0-24 小时的年龄) 放置于 24-孔微量滴定板中的人工饵料上并由移液管取用试验溶液以 200 ppm 的施药量进行处理。在 4 天的培养期后, 就卵的死亡率、幼虫死亡率、和生长调节检查样品。下面化合物达到了对烟芽夜蛾的至少 80% 控制:

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-1, 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, XXXI-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 和 XXXI-7.

小菜蛾:

在有人工饵料的 24-孔微量滴定板 (MTP) 上利用移液管用试验溶液以 18.2 ppm 的施药量进行处理。在干燥后, 将 MTP 用幼虫 (L2) (10-15 个/每孔) 感染。在 5 天的培养期后, 就幼虫死亡率、拒食情况 (antifeedant) 和生长调节检查样品。下面化合物达到了对小菜蛾的至少 80% 控制:

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 和 XXX-51

桃蚜:

将向日葵叶片放置于在 24-孔微量滴定板中的琼脂上, 以 200 ppm 的施药量喷雾试验溶液。在干燥后, 叶片用混合年龄的蚜虫群体感染。在 6 天的培养期后, 就死亡率检查样品。下面化合物达到了对桃蚜的至少 80%控制:

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

二斑叶螨:

在 24-孔微量滴定板中的琼脂上的大豆叶片用试验溶液以 200 ppm 的施药量进行喷雾。在干燥后, 叶片用混合年龄的螨虫群体感染。8 天后, 就卵死亡率、幼虫死亡率、和成虫死亡率检查样品。下面化合物达到了对二斑叶螨的至少 80%控制:

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

埃及伊蚊:

10-15 只埃及伊蚊幼虫 (L2) 与营养混合物一起放置于 96-孔微量滴定板中。2ppm 施药量的试验溶液用移液管移取到各孔中。2 天后, 检查昆虫死亡率和生长抑制。下面化合物达到对埃及伊蚊的至少 80%控制。

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-85,
XXX-84, XXX-87, XXX-88, XXX90, XXX-93, XXX-94, XXX-97, XXXI-2, XXXI-7,
XXXI-8, XXXII-10, XXXII-4, XXX-104, XXX-106, XXX1-1, XXX-111, XXX-113, XXX-
114, XXX-118, XXX-12, XXX-13, XXX1-4, 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,
XXX-109, XXX-45, XXX-51, XXX-6, XXX-66 XXX-121 和 XXX-8.