

發明專利說明書 200526608

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：93140150

※申請日期：93.12.22

※IPC 分類：A61N

一、發明名稱：(中文/英文)

對抗昆蟲、節肢動物及線蟲之1-(氮唞-2-基)胺-1,2-二苯基乙烷
1-(AZOLIN-2-YL)AMINO-1,2-DIPHENYLETHANE COMPOUNDS
FOR COMBATING INSECTS, ARACHNIDS AND NEMATODES

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

德商巴地斯顏料化工廠
BASF AKTIENGESELLSCHAFT

代表人：(中文/英文)

1. 貝蕾爾
BIELLER
2. 寇斯特
KOESTER

住居所或營業所地址：(中文/英文)

德國來恩河勞域沙芬市卡羅玻斯克街
CARL-BOSCH-STRASSE, 67056 LUDWIGSHAFEN, GERMANY

國籍：(中文/英文)

德國 GERMANY

三、發明人：(共 13 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 馬庫斯 柯德斯
KORDES, MARKUS
2. 麥可 霍夫曼
HOFMANN, MICHAEL
3. 麥可 帕爾
PUHL, MICHAEL
4. 諾伯特 枸茲
GOETZ, NORBERT
5. 麥可 拉克
RACK, MICHAEL
6. 恩斯特 鮑曼
BAUMANN, ERNST
7. 沃夫崗 凡 迪恩
VON DEYN, WOLFGANG
8. 湯瑪斯 史奇密德
SCHMIDT, THOMAS
9. 利維歐 泰德斯齊
TEDESCHI, LIVIO
10. 麥可 F 崔爾希
TREACY, MICHAEL F.
11. 黛博拉 L 考伯特森
CULBERTSON, DEBORAH L.
12. 東尼 布齊
BUCCI, TONI
13. 大衛 G 昆恩
KUHN, DAVID G.

國 籍：(中文/英文)

- | | |
|------------|---------|
| 1.-8.均德國 | GERMANY |
| 9.義大利 | ITALY |
| 10.-13.均美國 | U.S.A. |

四、聲明事項：

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

申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1. 美國；2003年12月23日；60/531,612

2.

無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1.

2.

主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

主張專利法第三十條生物材料：

須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於1-(吡咯啉(azolin)-2-基)胺基-1,2-二苯基乙烷化合物，其可用於對抗昆蟲，蜘蛛(arachnids)，及線蟲。本發明亦關於一種對抗動物害蟲選自昆蟲，蜘蛛，及線蟲之方法，及對抗動物害蟲之農業組合物。

【先前技術】

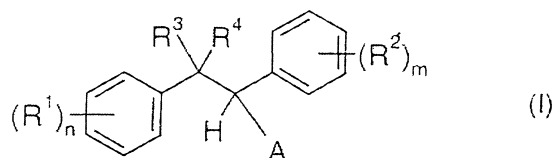
動物害蟲，特別是昆蟲，蜘蛛，及線蟲，破壞生長及收穫作物，及侵襲木製住宅及商業結構，對於食物供給及財產造成重大經濟損失。雖然許多除害劑已知，但是由於目標害蟲對於該等劑具有發展抗性之能力，仍需要新劑以對抗昆蟲，蜘蛛，及線蟲。

Jennings et al. Pesticide Biochemistry and Physiology 30, 1988, p.190-197述及幾種2-苯基胺基嘧啶及2-苯甲基胺基嘧啶，其具有殺昆蟲活性。Biosci. Biotech. Biochem. 1992, 56(7), 1062-1065揭示苯基-，苯甲基-，及苯乙基嘧啶具有殺昆蟲活性。然而，這些化合物在活性或活性範圍上有限。

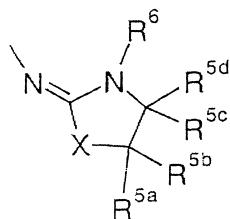
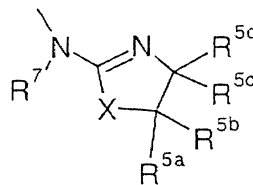
【發明內容】

本發明之一目的為提供具有良好除害活性，對於許多不同動物害蟲，特別是對於難以控制之昆蟲，蜘蛛，及線蟲，顯示廣泛活性範圍之化合物。

已發現這些目的可由下通式I之1-(吡咯啉-2-基)胺基-1,2-二苯基乙烷化合物達成：



其中 A 為下式 A¹ 或 A² 之基：

A¹A²

其中

m 為 0, 1, 2, 3, 4 或 5；

n 為 0, 1, 2, 3, 4 或 5；

X 為硫或氧；

R¹, R² 各獨立為鹵素, OH, SH, NH₂, SO₃H, COOH, 氰基, 硝基, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-烷氧基, C₁-C₆-烷胺基, 二(C₁-C₆-烷基)胺基, C₁-C₈-烷硫基, C₂-C₆-烯基, C₂-C₆-烯基氧基, C₂-C₆-烯基胺基, C₂-C₆-烯基硫基, C₂-C₆-炔基, C₂-C₆-炔基氧基, C₂-C₆-炔基胺基, C₂-C₆-炔基硫基, C₁-C₆-烷基磺醯基, C₁-C₆-烷基硫氧基(sulfoxyl), C₂-C₆-烯基磺醯基, C₂-C₆-炔基磺醯基, 甲醯基, C₁-C₆-烷基羰基, C₂-C₆-烯基羰基, C₂-C₆-炔基羰基, C₁-C₆-烷氧基羰基, C₂-C₆-烯基氧基羰基, C₂-C₆-炔基氧基羰基, 羰基氧基(=HC(O)-或甲醯基氧基), C₁-C₆-烷基羰基氧基, C₁-C₆-烯基羰基氧基, C₁-C₆-炔基羰

基氧基，其中上述基之脂族基中碳原子可攜帶1, 2或3個R[#]基之任何組合，

C(O)NR^aR^b，(SO₂)NR^aR^b，其中R^a及R^b各獨立為氫，C₁-C₆-烷基，C₂-C₆-烯基，或C₂-C₆-炔基，其中這些基中碳原子可攜帶1, 2或3個R[#]基之任何組合，

Y-Ar基或Y-Cy基，其中

Y 為一個單鍵，氧，硫，C₁-C₆-烷二基，或C₁-C₆-烷二基氧基，

Ar 為苯基，萘基，或一個單環或雙環之5至10員雜芳環，其含有1, 2, 3或4個雜原子選自氧，硫，及氮作為環成員，其中Ar未經取代或可攜帶1, 2, 3, 4或5個R[#]基之任何組合；及

Cy 為C₃-C₁₂-環烷基，其未經取代或經1, 2, 3, 4或5個R[#]基之任何組合取代；

其中結合於苯環之相鄰碳原子之二個R¹基或二個R²基可與該碳原子一起形成一個稠合苯環，一個稠合之飽和或部份未飽和之5-, 6-或7-員碳環，或一個稠合之5-, 6-或7-員雜環，其含有1, 2, 3或4個雜原子選自氧，硫，及氮作為環成員，其中稠合環未經取代或可攜帶1, 2, 3或4個R[#]基之任何組合；

R³, R⁴ 各獨立為氫，C₁-C₆-烷基，C₁-C₆-鹵烷基，C₃-C₆-環烷基，其中這些基中碳原子可攜帶1, 2或3個R[#]

基之任何組合，

苯基或苯甲基，各未經取代，或經1至5個鹵素，1至3個C₁-C₆-烷基，C₁-C₆-鹵烷基，C₁-C₆-烷硫基，C₁-C₆-鹵烷硫基，C₁-C₆-烷氧基，或C₁-C₆-鹵烷氧基之任何組合取代；

R^{5a}, R^{5b}, R^{5c}, R^{5d} 各獨立為氫，C₁-C₆-烷基，C₁-C₆-鹵烷基，C₁-C₆-烷胺基，C₁-C₆-烷氧基，C₃-C₆-環烷基，其中這些基中碳原子可攜帶1, 2或3個R[#]基，鹵素，氰基，硝基，羥基，巰基，胺基之任何組合，苯基或苯甲基，各未經取代，或經1至5個鹵素，1至3個C₁-C₆-烷基，C₁-C₆-鹵烷基，C₁-C₆-烷硫基，C₁-C₆-鹵烷硫基，C₁-C₆-烷氧基，或C₁-C₆-鹵烷氧基之任何組合取代；

R⁶ 為氫，氰基，硝基，C₁-C₆-烷基，甲醯基，C₁-C₆-烷基羰基，C₁-C₆-烷氧基羰基，C₁-C₆-烷硫基羰基，其中上述基之脂族基中碳原子可攜帶1, 2或3個R[#]基之任何組合，

C(O)NR^aR^b，或(SO₂)NR^aR^b，其中R^a及R^b如上述定義，苯基，苯基氧基，或苯甲基，最後三個基各可未經取代，或經1至5個鹵素，1至3個C₁-C₆-烷基，C₁-C₆-鹵烷基，C₁-C₆-烷硫基，C₁-C₆-鹵烷硫基，C₁-C₆-烷氧基，或C₁-C₆-鹵烷氧基之任何組合取代；

R⁷ 為氫，氰基，硝基，C₁-C₆-烷基，甲醯基，C₁-C₆-

烷基羰基， C_1-C_6 -烷氧基羰基， C_1-C_6 -烷硫基羰基，其中上述基之脂族基中碳原子可攜帶1, 2或3個 $R^\#$ 基之任何組合，

$C(O)NR^aR^b$ ，或 $(SO_2)NR^aR^b$ ，其中 R^a 及 R^b 如上述定義，苯基，苯基氧基，或苯甲基，最後三個基各可未經取代，或經1至5個鹵素，1至3個 C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_1-C_6 -烷硫基， C_1-C_6 -鹵烷硫基， C_1-C_6 -烷氧基，或 C_1-C_6 -鹵烷氧基之任何組合取代；

$R^\#$ 為鹵素，氰基，硝基，羥基，巰基，胺基，羧基， C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -烷氧基， C_2-C_6 -烯基氧基， C_2-C_6 -炔基氧基， C_1-C_6 -鹵烷氧基，或 C_1-C_6 -烷硫基；

及式I化合物之農業上可接受鹽。

【實施方式】

因此，本發明係關於通式I之1-(吡咯啉-2-基)胺基-1,2-二苯基乙烷化合物及其農業上可接受鹽。這些化合物具有高除害活性，對於廣泛範圍之動物害蟲選自昆蟲，蜘蛛，及線蟲有效。

因此，本發明亦關於一種對抗動物害蟲選自昆蟲，蜘蛛，及線蟲之方法，其包含使動物害蟲，其棲息處，繁殖地，食物供給，動物害蟲生長或可能生長之植物，種子，土壤，區域，物質，或環境，或欲保護避免昆蟲，蜘蛛，或線蟲侵襲或侵害之物質，植物，種子，土壤，表面，或空間接

觸除害有效量之至少一種通式I之1-(吡咯啉-2-基)胺基-1,2-二苯基乙烷化合物及/或至少一種其農業上可接受鹽。

此外，本發明提供一種保護作物避免昆蟲，蜘蛛，或線蟲侵襲或侵害之方法，其包含使一種作物接觸除害有效量之一種通式I之1-(吡咯啉-2-基)胺基-1,2-二苯基乙烷化合物及/或至少一種其鹽。

此外，本發明係關於農業組合物，較佳呈直接噴灑溶液，乳液，糊，油分散液，粉末，散佈物質，粉塵(dusts)，或顆粒形式，其包含至少一種如上定義之通式I之1-(吡咯啉-2-基)胺基-1,2-二苯基乙烷化合物或其鹽混合一或多種農藝上可接受之惰性，固體，或液體載劑，及若需要，至少一種表面活性劑。

通式I之化合物可具有一或多個對掌中心，在該情況彼等以對映體或非對映體之混合物存在。本發明提供純對映體或非對映體或其混合物。通式I之化合物亦可以不同互變體之形式存在。本發明包含單一互變體(若可分離)及互變體之混合物。

式I化合物之鹽特別是農業上可接受之鹽。彼等可以一種慣用方法形成，例如由該化合物與該陰離子之一種酸反應，若式I化合物具有一個鹼官能基，或由式I之酸性化合物與一種適合鹼反應。

適合之農業上有用鹽特別是陽離子之鹽或酸之酸加成鹽，其陽離子及陰離子分別對於本發明化合物之作用無任何不利影響。適合之陽離子特別是鹼金屬，較佳為鋰，鈉，

及鉀，鹼土金屬，較佳為鈣，鎂，及鋇，過渡金屬，較佳為錳，銅，鋅，及鐵，以及銨(NH_4^+)及經取代之銨，其中1至4個氫原子以 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基， $\text{C}_1\text{-C}_4$ -羥基烷基， $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基， $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基，羥基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基- $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基，苯基，或苯甲基替代之離子。經取代之銨離子之實例包含甲基銨，異丙基銨，二甲基銨，二異丙基銨，三甲基銨，四甲基銨，四乙基銨，四丁基銨，2-羥基乙基銨，2-(2-羥基乙氧基)乙基銨，雙(2-羥基乙基)銨，苯甲基三甲基銨，及苯甲基三乙基銨，及磷離子，銦離子，較佳為三($\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基)銦，及氧化銦(sulfoxonium)離子，較佳為三($\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基)氧化銦。

有用酸加成鹽之陰離子主要為氯，溴，氟，硫酸氫，硫酸，磷酸二氫，磷酸氫，磷酸，硝酸，碳酸氫，碳酸，六氟矽酸，六氟磷酸，苯甲酸，及 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷酸，較佳為甲酸，乙酸，丙酸，及丁酸之陰離子。彼等可由式Ia及Ib之化合物與一種對應陰離子之酸，較佳為鹽酸，氫溴酸，硫酸，磷酸，或硝酸，反應而形成。

上述變數定義中所述之有機基，如術語鹵素，為各基成員之集合術語。字首 $\text{C}_n\text{-C}_m$ 在各情況中表示各基可能之碳原子數。

術語鹵素在各情況中表示氯，溴，氟，或碘，特別是氟，氯，或溴。

其他意義之實例為：

本文中所用及於 $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷氧基， $\text{C}_1\text{-C}_6$ -烷胺基，二($\text{C}_1\text{-C}_6$ -

烷基)胺基， C_1-C_6 -烷基硫基， C_1-C_6 -烷基磺基， C_1-C_6 -烷基硫氧基， C_1-C_6 -烷基羰基， C_1-C_6 -烷基羧基， C_1-C_6 -烷基羧基之烷基中術語「 C_1-C_6 -烷基」表具有1至6個碳原子，特別是1至4個碳原子之飽和直鏈或分支之烴基，例如甲基，乙基，丙基，1-甲基乙基，丁基，1-甲基丙基，2-甲基丙基，1,1-二甲基乙基，戊基，1-甲基丁基，2-甲基丁基，3-甲基丁基，2,2-二甲基丙基，1-乙基丙基，己基，1,1-二甲基丙基，1,2-二甲基丙基，1-甲基戊基，2-甲基戊基，3-甲基戊基，4-甲基戊基，1,1-二甲基丁基，1,2-二甲基丁基，1,3-二甲基丁基，2,2-二甲基丁基，2,3-二甲基丁基，3,3-二甲基丁基，1-乙基丁基，2-乙基丁基，1,1,2-三甲基丙基，1,2,2-三甲基丙基，1-乙基-1-甲基丙基，1-乙基-2-甲基丙基，庚基，辛基，2-乙基己基，壬基，及癸基，及其異構物。 C_1-C_4 -烷基意為例如甲基，乙基，丙基，1-甲基乙基，丁基，1-甲基丙基，2-甲基丙基，或1,1-二甲基乙基。

在各烷基中碳原子可攜帶1, 2或3個 $R^{\#}$ 基。換言之，這些基中各氫原子可獨立為上述 $R^{\#}$ 基之一替代。在 $R^{\#}$ 基為鹵素之情況，該烷基中一般1, 2, 3或所有氫原子為鹵素，特別是氟或氯替代。這些基亦稱為鹵烷基。在 $R^{\#}$ 基為氰基，硝基，羥基，巰基，胺基，羧基， C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -烷氧基， C_2-C_6 -烯基氧基， C_2-C_6 -炔基氧基， C_1-C_6 -鹵烷氧基，或 C_1-C_6 -烷基硫基之情況，該烷基中一般1或2個氫原子可為 $R^{\#}$ 基替代。

本文中所用之術語「 C_1-C_6 -鹵烷基」表具有1至6個碳原

子之直鏈或分支之飽和烷基(如上述)中一些或所有氫原子可以上述鹵素原子替代，例如C₁-C₄-鹵烷基，如氟甲基，溴甲基，二氯甲基，三氯甲基，氟甲基，二氟甲基，三氟甲基，氯氟甲基，二氯氟甲基，氯二氟甲基，1-氟乙基，1-溴乙基，1-氯乙基，2-氟乙基，2,2-二氟乙基，2,2,2-三氟乙基，2-氯-2-氟乙基，2-氯-2,2-二氟乙基，2,2-二氯-2-氟乙基，2,2,2-三氯乙基，五氟乙基，等。

本文中所用之術語「C₁-C₆-烷氧基」表具有1至6個碳原子之直鏈或分支之飽和烷基(如上述)經由一個氧原子連接。實例包括C₁-C₆-烷氧基，如甲氧基，乙氧基，OCH₂-C₂H₅，OCH(CH₃)₂，正丁氧基，OCH(CH₃)₂-C₂H₅，OCH₂-CH(CH₃)₂，OC(CH₃)₃，正戊氧基，1-甲基丁氧基，2-甲基丁氧基，3-甲基丁氧基，1,1-二甲基丙氧基，1,2-二甲基丙氧基，2,2-二甲基丙氧基，1-乙基丙氧基，正己氧基，1-甲基戊氧基，2-甲基戊氧基，3-甲基戊氧基，4-甲基戊氧基，1,1-二甲基丁氧基，1,2-二甲基丁氧基，1,3-二甲基丁氧基，2,2-二甲基丁氧基，2,3-二甲基丁氧基，3,3-二甲基丁氧基，1-乙基丁氧基，2-乙基丁氧基，1,1,2-三甲基丙氧基，1,2,2-三甲基丙氧基，1-乙基-1-甲基丙氧基，1-乙基-2-甲基丙氧基，等。

本文中所用之術語「C₁-C₆-鹵烷氧基」表上述之C₁-C₆-烷氧基中氫原子部份或完全為氟，氯，溴，及/或碘取代，即例如C₁-C₆-鹵烷氧基，如氟甲氧基，二氯甲氧基，三氯甲氧基，氟甲氧基，二氟甲氧基，三氟甲氧基，氯氟甲氧基，

二氟甲氧基，氯二氟甲氧基，2-氟乙氧基，2-氯乙氧基，2-溴乙氧基，2-碘乙氧基，2,2-二氟乙氧基，2,2,2-三氟乙氧基，2-氯-2-氟乙氧基，2-氯-2,2-二氟乙氧基，2,2-二氯-2-氟乙氧基，2,2,2-三氯乙氧基，五氟乙氧基，2-氟丙氧基，3-氟丙氧基，2,2-二氟丙氧基，2,3-二氟丙氧基，2-氯丙氧基，3-氯丙氧基，2,3-二氯丙氧基，2-溴丙氧基，3-溴丙氧基，3,3,3-三氟丙氧基，3,3,3-三氯丙氧基，2,2,3,3,3-五氟丙氧基，七氟丙氧基，1-(氟甲基)-2-氟乙氧基，1-(氯甲基)-2-氯乙氧基，1-(溴甲基)-2-溴乙氧基，4-氟丁氧基，4-氯丁氧基，4-溴丁氧基，九氟丁氧基，5-氟-1-戊氧基，5-氯-1-戊氧基，5-溴-1-戊氧基，5-碘-1-戊氧基，5,5,5-三氯-1-戊氧基，十一氟戊氧基，6-氟-1-己氧基，6-氯-1-己氧基，6-溴-1-己氧基，6-碘-1-己氧基，6,6,6-三氯-1-己氧基，或十二氟己氧基，特別是氯甲氧基，氟甲氧基，二氟甲氧基，三氟甲氧基，2-氟乙氧基，2-氯乙氧基，或2,2,2-三氟乙氧基。

本文中所用之術語「 C_1-C_6 -烷氧基- C_1-C_6 -烷基」表 C_1-C_6 -烷基中1個碳原子攜帶一個如上述之 C_1-C_6 -烷氧基。實例為 CH_2-OCH_3 ， $CH_2-OC_2H_5$ ，正丙氧基甲基， $CH_2-OCH(CH_3)_2$ ，正丁氧基甲基，(1-甲基丙氧基)甲基，(2-甲基丙氧基)甲基， $CH_2-OC(CH_3)_3$ ，2-(甲氧基)乙基，2-(乙氧基)乙基，2-(正丙氧基)乙基，2-(1-甲基乙氧基)乙基，2-(正丁氧基)乙基，2-(1-甲基丙氧基)乙基，2-(2-甲基丙氧基)乙基，2-(1,1-二甲基乙氧基)乙基，2-(甲氧基)丙基，2-(乙氧基)丙基，2-(正丙氧基)丙基，2-(1-甲基乙氧基)丙基，2-(正丁氧基)丙基，2-(1-

甲基丙氧基)丙基，2-(2-甲基丙氧基)丙基，2-(1,1-二甲基乙氧基)丙基，3-(甲氧基)丙基，3-(乙氧基)丙基，3-(正丙氧基)丙基，3-(1-甲基乙氧基)丙基，3-(正丁氧基)丙基，3-(1-甲基丙氧基)丙基，3-(2-甲基丙氧基)丙基，3-(1,1-二甲基乙氧基)丙基，2-(甲氧基)丁基，2-(乙氧基)丁基，2-(正丙氧基)丙基，2-(1-甲基乙氧基)丁基，2-(正丁氧基)丁基，2-(1-甲基丙氧基)丁基，2-(2-甲基丙氧基)丁基，2-(1,1-二甲基乙氧基)丁基，3-(甲氧基)丁基，3-(乙氧基)丁基，3-(正丙氧基)丁基，3-(1-甲基乙氧基)丁基，3-(正丁氧基)丁基，3-(1-甲基丙氧基)丁基，3-(2-甲基丙氧基)丁基，3-(1,1-二甲基乙氧基)丁基，4-(甲氧基)丁基，4-(乙氧基)丁基，4-(正丙氧基)丁基，4-(1-甲基乙氧基)丁基，4-(正丁氧基)丁基，4-(1-甲基丙氧基)丁基，4-(2-甲基丙氧基)丁基，4-(1,1-二甲基乙氧基)丁基，等。

本文中所用之術語「 C_1-C_6 -烷基羰基」表具有1至6個碳原子之直鏈或分支之飽和烷基(如上述)經由烷基任何鍵上羰基之碳原子結合。實例包括 C_1-C_6 -烷基羰基，如 $CO-CH_3$ ， $CO-C_2H_5$ ，正丙基羰基，1-甲基乙基羰基，正丁基羰基，1-甲基丙基羰基，2-甲基丙基羰基，1,1-二甲基乙基羰基，正戊基羰基，1-甲基丁基羰基，2-甲基丁基羰基，3-甲基丁基羰基，1,1-二甲基丙基羰基，1,2-二甲基丙基羰基，2,2-二甲基丙基羰基，1-乙基丙基羰基，正己基羰基，1-甲基戊基羰基，2-甲基戊基羰基，3-甲基戊基羰基，4-甲基戊基羰基，1,1-二甲基丁基羰基，1,2-二甲基丁基羰基，1,3-二甲基丁

基羰基，2,2-二甲基丁基羰基，2,3-二甲基丁基羰基，3,3-二甲基丁基羰基，1-乙基丁基羰基，2-乙基丁基羰基，1,1,2-三甲基丙基羰基，1,2,2-三甲基丙基羰基，1-乙基-1-甲基丙基羰基，或1-乙基-2-甲基丙基羰基，等。

本文中所用之術語「 C_1-C_6 -烷氧基羰基」表具有1至6個碳原子之直鏈或分支之烷氧基(如上述)經由羰基之碳原子結合。實例包括 C_1-C_6 -烷氧基羰基，如 $CO-OCH_3$ ， $CO-OC_2H_5$ ， $COO-CH_2-C_2H_5$ ， $CO-OCH(CH_3)_2$ ，正丁氧基羰基， $CO-OCH(CH_3)-C_2H_5$ ， $CO-OCH_2-CH(CH_3)_2$ ， $CO-OC(CH_3)_3$ ，正戊氧基羰基，1-甲基丁氧基羰基，2-甲基丁氧基羰基，3-甲基丁氧基羰基，2,2-二甲基丙氧基羰基，1-乙基丙氧基羰基，正己氧基羰基，1,1-二甲基丙氧基羰基，1,2-二甲基丙氧基羰基，1-甲基戊氧基羰基，2-甲基戊氧基羰基，3-甲基戊氧基羰基，4-甲基戊氧基羰基，1,1-二甲基丁氧基羰基，1,2-二甲基丁氧基羰基，1,3-二甲基丁氧基羰基，2,2-二甲基丁氧基羰基，2,3-二甲基丁氧基羰基，3,3-二甲基丁氧基羰基，1-乙基丁氧基羰基，2-乙基丁氧基羰基，1,1,2-三甲基丙氧基羰基，1,2,2-三甲基丙氧基羰基，1-乙基-1-甲基丙氧基羰基，或1-乙基-2-甲基丙氧基羰基。

本文中所用之術語「 C_1-C_6 -烷基羰基氧基」表具有1至6個碳原子之直鏈或分支之飽和烷基(如上述)經由烷基任何鍵上羰基氧基之碳原子結合。實例包括 C_1-C_6 -烷基羰基氧基，如 $O-CO-CH_3$ ， $O-CO-C_2H_5$ ，正丙基羰基氧基，1-甲基乙基羰基氧基，正丁基羰基氧基，1-甲基丙基羰基氧基，

2-甲基丙基羰基氧基，1,1-二甲基乙基羰基氧基，正戊基羰基氧基，1-甲基丁基羰基氧基，2-甲基丁基羰基氧基，3-甲基丁基羰基氧基，1,1-二甲基丙基羰基氧基，1,2-二甲基丙基羰基氧基，等。

本文中所用之術語「 C_1-C_6 -烷硫基(C_1-C_6 -烷基-S-)」表具有1至6個碳原子之直鏈或分支之飽和烷基(如上述)經由一個硫原子連接，例如 C_1-C_4 -烷硫基，如甲硫基，乙硫基，丙硫基，1-甲基乙硫基，丁硫基，1-甲基丙硫基，2-甲基丙硫基，1,1-二甲基乙硫基，正戊硫基，1-甲基丁硫基，2-甲基丁硫基，3-甲基丁硫基，2,2-二甲基丙硫基，1-乙基丙硫基，正己硫基，1,1-二甲基丙硫基，1,2-二甲基丙硫基，1-甲基戊硫基，2-甲基戊硫基，3-甲基戊硫基，4-甲基戊硫基，1,1-二甲基丁硫基，1,2-二甲基丁硫基，1,3-二甲基丁硫基，2,2-二甲基丁硫基，2,3-二甲基丁硫基，3,3-二甲基丁硫基，1-乙基丁硫基，2-乙基丁硫基，1,1,2-三甲基丙硫基，1,2,2-三甲基丙硫基，1-乙基-1-甲基丙硫基，或1-乙基-2-甲基丙硫基。

本文中所用之術語「 C_1-C_6 -烷硫基羰基」表具有1至6個碳原子之直鏈或分支之烷硫基(如上述)經由羰基之碳原子連接。實例包括如 $CO-SCH_3$ ， $CO-SC_2H_5$ ， $CO-SCH_2-C_2H_5$ ， $CO-SCH(CH_3)_2$ ，正丁硫基羰基， $CO-SCH-(CH_3)-C_2H_5$ ， $CO-SCH_2-CH(CH_3)_2$ ， $CO-SC(CH_3)_3$ ，正戊硫基羰基，1-甲基丁硫基羰基，2-甲基丁硫基羰基，3-甲基丁硫基羰基，2,2-二甲基丙硫基羰基，1-乙基丙硫基羰基，正己硫基羰基，1,1-

二甲基丙硫基羰基，1,2-二甲基丙硫基羰基，1-甲基戊硫基羰基，2-甲基戊硫基羰基，3-甲基戊硫基羰基，4-甲基戊硫基羰基，1,1-二甲基丁硫基羰基，1,2-二甲基丁硫基羰基，1,3-二甲基丁硫基羰基，2,2-二甲基丁硫基羰基，2,3-二甲基丁硫基羰基，3,3-二甲基丁硫基羰基，1-乙基丁硫基羰基，2-乙基丁硫基羰基，1,1,2-三甲基丙硫基羰基，1,2,2-三甲基丙硫基羰基，1-乙基-1-甲基丙硫基羰基，或1-乙基-2-甲基丙硫基羰基。

本文中所用之術語「 C_1-C_6 -烷基亞磺醯基」(C_1-C_6 -烷基硫氧基(sulfoxyl): C_1-C_6 -烷基-S(=O)-)表具有1至6個碳原子之直鏈或分支之飽和烴基(如上述)經由烷基任何鍵上亞磺醯基之硫原子結合。實例包括 C_1-C_6 -烷基亞磺醯基： $SO-CH_3$ ， $SO-C_2H_5$ ，正丙基亞磺醯基，1-甲基乙基亞磺醯基，正丁基亞磺醯基，1-甲基丙基亞磺醯基，2-甲基丙基亞磺醯基，1,1-二甲基乙基亞磺醯基，正戊基亞磺醯基，1-甲基丁基亞磺醯基，2-甲基丁基亞磺醯基，3-甲基丁基亞磺醯基，1,1-二甲基丙基亞磺醯基，1,2-二甲基丙基亞磺醯基，2,2-二甲基丙基亞磺醯基，1-乙基丙基亞磺醯基，正己基亞磺醯基，1-甲基戊基亞磺醯基，2-甲基戊基亞磺醯基，3-甲基戊基亞磺醯基，4-甲基戊基亞磺醯基，1,1-二甲基丁基亞磺醯基，1,2-二甲基丁基亞磺醯基，1,3-二甲基丁基亞磺醯基，2,2-二甲基丁基亞磺醯基，2,3-二甲基丁基亞磺醯基，3,3-二甲基丁基亞磺醯基，1-乙基丁基亞磺醯基，2-乙基丁基亞磺醯基，1,1,2-三甲基丙基亞磺醯基，1,2,2-三甲基丙

基亞磺醯基，1-乙基-1-甲基丙基亞磺醯基，或1-乙基-2-甲基丙基亞磺醯基。

術語「 C_1-C_6 -烷基胺基」表一個二級胺基攜帶一個如上述定義之烷基，例如甲胺基，乙胺基，丙胺基，1-甲基乙胺基，丁胺基，1-甲基丙胺基，2-甲基丙胺基，1,1-二甲基乙胺基，戊胺基，1-甲基丁胺基，2-甲基丁胺基，3-甲基丁胺基，2,2-二甲基丙胺基，1-乙基丙胺基，己胺基，1,1-二甲基丙胺基，1,2-二甲基丙胺基，1-甲基戊胺基，2-甲基戊胺基，3-甲基戊胺基，4-甲基戊胺基，1,1-二甲基丁胺基，1,2-二甲基丁胺基，1,3-二甲基丁胺基，2,2-二甲基丁胺基，2,3-二甲基丁胺基，3,3-二甲基丁胺基，1-乙基丁胺基，2-乙基丁胺基，1,1,2-三甲基丙胺基，1,2,2-三甲基丙胺基，1-乙基-1-甲基丙胺基，1-乙基-2-甲基丙胺基。

術語「二(C_1-C_6 -烷基)胺基」表一個三級胺基攜帶二個如上述定義之烷基，例如二甲基胺基，二乙基胺基，二正丙基胺基，二異丙基胺基，N-乙基-N-甲基胺基，N-(正丙基)-N-甲基胺基，N-(異丙基)-N-甲基胺基，N-(正丁基)-N-甲基胺基，N-(正戊基)-N-甲基胺基，N-(2-丁基)-N-甲基胺基，N-(異丁基)-N-甲基胺基，N-(正戊基)-N-甲基胺基，N-(正丙基)-N-乙基胺基，N-(異丙基)-N-乙基胺基，N-(正丁基)-N-乙基胺基，N-(正戊基)-N-乙基胺基，N-(2-丁基)-N-乙基胺基，N-(異丁基)-N-乙基胺基，N-(正戊基)-N-乙基胺基，等。

本文中所用之術語「 C_1-C_6 -烷基磺醯基」(C_1-C_6 -烷基-S(=O)₂-)表具有1至6個碳原子之直鏈或分支之飽和烷基(如

上述)經由烷基任何鍵上磺醯基之硫原子結合。實例包括 C_1-C_6 -烷基磺醯基，如 SO_2-CH_3 ， $SO_2-C_2H_5$ ，正丙基磺醯基， $SO_2-CH(CH_3)_2$ ，正丁基磺醯基，1-甲基丙基磺醯基，2-甲基丙基磺醯基， $SO_2-C(CH_3)_3$ ，正戊基磺醯基，1-甲基丁基磺醯基，2-甲基丁基磺醯基，3-甲基丁基磺醯基，1,1-二甲基丙基磺醯基，1,2-二甲基丙基磺醯基，2,2-二甲基丙基磺醯基，1-乙基丙基磺醯基，正己基磺醯基，1-甲基戊基磺醯基，2-甲基戊基磺醯基，3-甲基戊基磺醯基，4-甲基戊基磺醯基，1,1-二甲基丁基磺醯基，1,2-二甲基丁基磺醯基，1,3-二甲基丁基磺醯基，2,2-二甲基丁基磺醯基，2,3-二甲基丁基磺醯基，3,3-二甲基丁基磺醯基，1-乙基丁基磺醯基，2-乙基丁基磺醯基，1,1,2-三甲基丙基磺醯基，1,2,2-三甲基丙基磺醯基，1-乙基-1-甲基丙基磺醯基，或1-乙基-2-甲基丙基磺醯基，等。

本文中所用及於 C_2-C_6 -烯基氧基， C_2-C_6 -烯基胺基， C_2-C_6 -烯基硫基， C_2-C_6 -烯基磺醯基， C_2-C_6 -烯基羰基， C_2-C_6 -烯基氧基羰基，及 C_2-C_6 -烯基羰基氧基之烯基中術語「 C_2-C_6 -烯基」表具有2至6個碳原子及一個雙鍵於任何位置之直鏈或分支之不飽和烴基，如乙烯基，1-丙烯基，2-丙烯基，1-甲基乙烯基，1-丁烯基，2-丁烯基，3-丁烯基，1-甲基-1-丙烯基，2-甲基-1-丙烯基，1-甲基-2-丙烯基，2-甲基-2-丙烯基，1-戊烯基，2-戊烯基，3-戊烯基，4-戊烯基，1-甲基-1-丁烯基，2-甲基-1-丁烯基，3-甲基-1-丁烯基，1-甲基-2-丁烯基，2-甲基-2-丁烯基，3-甲基-2-丁烯基，1-甲基-3-丁

烯基，2-甲基-3-丁烯基，3-甲基-3-丁烯基，1,1-二甲基-2-丙烯基，1,2-二甲基-1-丙烯基，1,2-二甲基-2-丙烯基，1-乙基-1-丙烯基，1-乙基-2-丙烯基，1-己烯基，2-己烯基，3-己烯基，4-己烯基，5-己烯基，1-甲基-1-戊烯基，2-甲基-1-戊烯基，3-甲基-1-戊烯基，4-甲基-1-戊烯基，1-甲基-2-戊烯基，2-甲基-2-戊烯基，3-甲基-2-戊烯基，4-甲基-2-戊烯基，1-甲基-3-戊烯基，2-甲基-3-戊烯基，3-甲基-3-戊烯基，4-甲基-3-戊烯基，1-甲基-4-戊烯基，2-甲基-4-戊烯基，3-甲基-4-戊烯基，4-甲基-4-戊烯基，1,1-二甲基-2-丁烯基，1,1-二甲基-3-丁烯基，1,2-二甲基-1-丁烯基，1,2-二甲基-2-丁烯基，1,2-二甲基-3-丁烯基，1,3-二甲基-1-丁烯基，1,3-二甲基-2-丁烯基，1,3-二甲基-3-丁烯基，2,2-二甲基-3-丁烯基，2,3-二甲基-1-丁烯基，2,3-二甲基-2-丁烯基，2,3-二甲基-3-丁烯基，3,3-二甲基-1-丁烯基，3,3-二甲基-2-丁烯基，1-乙基-1-丁烯基，1-乙基-2-丁烯基，1-乙基-3-丁烯基，2-乙基-1-丁烯基，2-乙基-2-丁烯基，2-乙基-3-丁烯基，1,1,2-三甲基-2-丙烯基，1-乙基-1-甲基-2-丙烯基，1-乙基-2-甲基-1-丙烯基，及1-乙基-2-甲基-2-丙烯基。

在各烯基中碳原子可攜帶1，2或3個R[#]基。換言之，這些基中各氫原子可獨立為上述R[#]基之一替代。在R[#]基為鹵素之情況，該烷基中一般1，2，3或所有氫原子為鹵素，特別是氟或氯替代。這些基亦稱為鹵烷基。在R[#]基為氰基，硝基，羥基，巰基，胺基，羧基，C₁-C₆-烷基，C₁-C₆-烷氧基，C₂-C₆-烯基氧基，C₂-C₆-炔基氧基，C₁-C₆-鹵烷氧基，或

C₁-C₆-烷硫基之情況，該烷基中一般1或2個氫原子可為R[#]基替代。

本文中所用之術語「C₂-C₆-烯基氧基」表具有2至6個碳原子之直鏈或分支之烯基(如上述)經由一個氧原子連接，如乙烯基氧基，烯丙基氧基(丙烯-3-基氧基)，甲基烯丙基氧基，丁烯-4-基氧基，等。

本文中所用之術語「C₂-C₆-烯基硫基」表具有2至6個碳原子之直鏈或分支之烯基(如上述)經由一個硫原子連接，如乙烯基硫基，烯丙基硫基(丙烯-3-基硫基)，甲基烯丙基硫基，丁烯-4-基硫基，等。

本文中所用之術語「C₂-C₆-烯基胺基」表具有2至6個碳原子之直鏈或分支之烯基(如上述)經由一個胺基連接，如乙烯基胺基，烯丙基胺基(丙烯-3-基胺基)，甲基烯丙基胺基，丁烯-4-基胺基，等。

本文中所用之術語「C₂-C₆-烯基磺醯基」表具有2至6個碳原子之直鏈或分支之烯基(如上述)經由一個磺醯基(SO₂)連接，如乙烯基磺醯基，烯丙基磺醯基(丙烯-3-基磺醯基)，甲基烯丙基磺醯基，丁烯-4-基磺醯基，等。

本文中所用及於C₂-C₆-炔基氧基，C₂-C₆-炔基胺基，C₂-C₆-炔基硫基，C₂-C₆-炔基磺醯基，C₂-C₆-炔基羰基，C₂-C₆-炔基氧基羰基，及C₁-C₆-炔基羰基氧基之炔基中術語「C₂-C₆-炔基」表具有2至10個碳原子及含有至少一個三鍵之直鏈或分支之不飽和烴基，如乙炔基，丙-1-炔-1-基，丙-2-炔-1-基，正丁-1-炔-1-基，正丁-1-炔-3-基，正丁-1-炔-4-基，正

丁-2-炔-1-基，正戊-1-炔-1-基，正戊-1-炔-3-基，正戊-1-炔-4-基，正戊-1-炔-5-基，正戊-2-炔-1-基，正戊-2-炔-4-基，正戊-2-炔-5-基，3-甲基丁-1-炔-3-基，3-甲基丁-1-炔-4-基，正己-1-炔-1-基，正己-1-炔-3-基，正己-1-炔-4-基，正己-1-炔-5-基，正己-1-炔-6-基，正己-2-炔-1-基，正己-2-炔-4-基，正己-2-炔-5-基，正己-2-炔-6-基，正己-3-炔-1-基，正己-3-炔-2-基，3-甲基戊-1-炔-1-基，3-甲基戊-1-炔-3-基，3-甲基戊-1-炔-4-基，3-甲基戊-1-炔-5-基，4-甲基戊-1-炔-1-基，4-甲基戊-2-炔-4-基，或4-甲基戊-2-炔-5-基，等。

在各炔基中碳原子可攜帶1，2或3個R[#]基。換言之，這些基中各氫原子可獨立為上述R[#]基之一替代。在R[#]基為鹵素之情況，該烷基中一般1，2，3或所有氫原子為鹵素，特別是氟或氯替代。這些基亦稱為鹵烷基。在R[#]基為氫基，硝基，羥基，巰基，胺基，羧基，C₁-C₆-烷基，C₁-C₆-烷氧基，C₂-C₆-烯基氧基，C₂-C₆-炔基氧基，C₁-C₆-鹵烷氧基，或C₁-C₆-烷硫基之情況，該烷基中一般1或2個氫原子可為R[#]基替代。

本文中所用之術語「C₂-C₆-炔基氧基」表具有2至6個碳原子之直鏈或分支之炔基(如上述)經由一個氧原子連接，如炔丙基氧基(丙炔-3-基氧基)，丁炔-3-基氧基，丁炔-4-基氧基，等。

本文中所用之術語「C₂-C₆-炔基硫基」表具有2至6個碳原子之直鏈或分支之炔基(如上述)經由一個硫原子連接，如

炔丙基硫基(丙炔-3-基硫基)，丁炔-3-基硫基，丁炔-4-基硫基，等。

本文中所用之術語「 C_2-C_6 -炔基胺基」表具有2至6個碳原子之直鏈或分支之炔基(如上述)經由一個胺基連接，如炔丙基胺基(丙炔-3-基胺基)，丁炔-3-基胺基，丁炔-4-基胺基，等。

本文中所用之術語「 C_2-C_6 -炔基磺醯基」表具有2至6個碳原子之直鏈或分支之炔基(如上述)經由一個磺醯基(SO_2)連接，如炔丙基磺醯基(丙炔-3-基磺醯基)，丁炔-3-基磺醯基，丁炔-4-基磺醯基，等。

本文中所用之術語「 C_3-C_{12} -環烷基」表具有3至12個碳原子，特別是3至6個碳原子之單或雙或多環烴基。單環基之實例包含環丙基，環丁基，環戊基，環己基，環庚基，環辛基，環壬基，或環癸基。雙環基之實例包含雙環[2.2.1]庚基，雙環[3.1.1]庚基，雙環[2.2.2]辛基，及雙環[3.2.1]壬基。三環基之實例為金剛烷基及高金剛烷基。

各環烷基可攜帶1，2，3，4或5個上述 $R^{\#}$ 基。換言之，這些基中1，2，3，4或5個氫原子可獨立為上述 $R^{\#}$ 基之一替代。環烷基上較佳之 $R^{\#}$ 基係選自鹵素，特別是氟或氯，及 C_1-C_6 -烷基。

本文中所用之術語「單或雙環雜芳環」表具有5或6個環成員之單環雜芳基，可包含一個稠合之5，6或7員環，因此具有8至10個環成員總數，其中在各情況中1，2，3或4個環成員為雜原子，獨立選自氧，氮，及硫。雜環基可經由一

個碳環成員或經由一個氮環成員連接於分子之其餘部份。稠合環包含C₅-C₇-環烷基，C₅-C₇-環烯基，或5至7員雜環基或苯基。

單環5至6員雜芳環之實例包括三吡基，吡吡基，嘧啶基，嗒吡基，吡啶基，噻吩基，呋喃基，吡咯基，吡啶基，咪啶基，三啶基，四啶基，噻啶基，嘔啶基，噻二啶基，嘔二啶基，異噻啶基，及異嘔啶基。

5至6員雜芳環攜帶一個稠合苯環之實例為喹啉基，異喹啉基，吲哚基，吲哚基，異吲哚基，吲啶基，苯并呋喃基，苯并噻吩基，苯并[b]噻啶基，苯并嘔啶基，苯并噻啶基，苯并嘔啶基，及苯并咪啶基。5至6員雜芳環攜帶一個稠合環烯基環之實例為二氫吲哚基，二氫吲哚基，二氫異吲哚基，二氫喹啉基，二氫異喹啉基，色烯基(chromenyl)，色滿基(chromanyl)，等。

術語「5至7員雜環基」包含上述定義之單環雜芳環及具有5，6或7個環成員之非芳族飽和或部份不飽和之雜環。非芳族環之實例包括吡咯啶基，吡啶基，咪啶基，吡咯基，四氫呋喃基，二氫呋喃基，1,3-二氧戊環基(dioxolanyl)，二氧戊烯環基(dioxolenyl)，硫啶基(thiolanyl)，二氫噻吩基，嘔啶基，異嘔啶基，嘔啶基，異嘔啶基，噻啶基，異噻啶基，噻啶基，異噻啶基，嘔硫啶基(oxathiolanyl)，哌啶基，哌吡基，哌喃基，二氫哌喃基，四氫哌喃基，二氧六環基，硫哌喃基，二氫硫哌喃基，四氫硫哌喃基，嗎啉基，噻吡基，等。

關於通式I化合物之除害活性，較佳為式I中各變數n, m, R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^{5a} , R^{5b} , R^{5c} , R^{5d} , R^6 及 R^7 獨立具有下列意義或更佳具有下列意義之組合之化合物。

n為0, 1或2；

m為0, 1或2；

m+n=0, 1, 2, 3或4，特別是1, 2, 3或4；

R^1 為鹵素， C_1 - C_4 -烷基， C_1 - C_4 -烷氧基， C_1 - C_4 -鹵烷基，及苯基，其未經取代，或經1至5個鹵素，1至3個 C_1 - C_6 -烷基， C_1 - C_6 -鹵烷基， C_1 - C_6 -烷硫基， C_1 - C_6 -鹵烷硫基， C_1 - C_6 -烷氧基，或 C_1 - C_6 -鹵烷氧基之任何組合取代，特別是氟，氯，溴，甲基，乙基，甲氧基，乙氧基，二氟甲基，三氟甲基，二氟甲氧基，三氟甲氧基，甲硫基，或苯基，其可未經取代，或可攜帶1, 2或3個基選自鹵素或甲基；

R^2 為鹵素， C_1 - C_4 -烷基， C_1 - C_4 -烷氧基， C_1 - C_4 -鹵烷基，及苯基，其未經取代，或經1至5個鹵素，1至3個 C_1 - C_6 -烷基， C_1 - C_6 -鹵烷基， C_1 - C_6 -烷硫基， C_1 - C_6 -鹵烷硫基， C_1 - C_6 -烷氧基，或 C_1 - C_6 -鹵烷氧基之任何組合取代，特別是氟，氯，溴，甲基，乙基，甲氧基，乙氧基，二氟甲基，三氟甲基，二氟甲氧基，三氟甲氧基，甲硫基，或苯基，其可未經取代，或可攜帶1, 2或3個基選自鹵素或甲基；

R^3 為氫或 C_1-C_4 -烷基，特別是氫或甲基，最佳為氫；

R^4 為氫， C_1-C_4 -烷基， C_1-C_4 -鹵烷基， C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基，或苯基，其未經取代，或經1至5個鹵素，1至3個 C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_1-C_6 -烷硫基， C_1-C_6 -鹵烷硫基， C_1-C_6 -烷氧基，或 C_1-C_6 -鹵烷氧基之任何組合取代；

R^{5a} , R^{5b} , R^{5c} 及 R^{5d} 各為氫，或這些基之一亦可為 C_1-C_4 -烷基；

R^6 為氫， C_1-C_4 -烷基，甲醯基， C_1-C_6 -烷基羰基， C_1-C_4 -鹵烷基羰基， C_1-C_6 -烷氧基羰基， C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷氧基羰基，或 C_1-C_6 -烷硫基羰基；

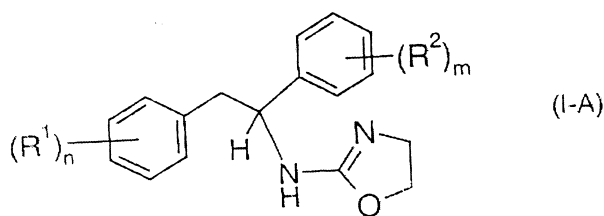
R^7 為氫。

在本發明之一個極佳具體實施例中， R^3 及 R^4 均為氫。在本發明之另一個較佳具體實施例中， R^3 為氫， R^4 係選自 C_1-C_4 -烷基， C_1-C_4 -鹵烷基， C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基，或苯基，其未經取代，或經1至5個鹵素，1至3個 C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_1-C_6 -烷硫基， C_1-C_6 -鹵烷硫基， C_1-C_6 -烷氧基，或 C_1-C_6 -鹵烷氧基之任何組合取代。在此具體實施例中， R^4 較佳為甲基，乙基，或特別是未經取代或經取代之苯基。

本發明之另一個具體實施例係關於式 I 中 R^{5a} ， R^{5b} ， R^{5c} 及 R^{5d} 中至少一個，較佳一或二個不為氫之化合物。在此情況，較佳為式 I 中 R^{5a} ， R^{5b} ， R^{5c} 及 R^{5d} 中 1 或 2 個係選自烷基，選擇性經取代之苯基，或選擇性經取代之苯甲基之化合物。

在化合物I中，較佳為A為式A²之化合物，特別是式I中A為A²，其中R⁷為H之化合物。這些化合物為式I中A為A¹，其中R⁶為氫之化合物之互變體。這些互變體係以平衡混合物存在。

在式I化合物中，較佳為下列式I-A之化合物，其中A為A²，X為O：



其中變數n, m, R¹及R²具有上述意義。這些化合物之實例為(R¹)_n及(R²)_m具有表A各列中所示之意義者(化合物I-A.1至I-A.1347)。在表A中，各基前之數目為其在苯環上之位置。

表 A：

| | (R ¹) _n | (R ²) _m |
|-----|---------------------------------|--------------------------------|
| A-1 | - | - |
| A-2 | 2-Cl | - |
| A-3 | 2-F | - |
| A-4 | 2-Br | - |
| A-5 | 2-OCH ₃ | - |
| A-6 | 2-CF ₃ | - |
| A-7 | 2-C ₆ H ₅ | - |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|------|---------------------------------|-----------|
| A-8 | 2-CH ₃ | - |
| A-9 | 3-Cl | - |
| A-10 | 3-F | - |
| A-11 | 3-Br | - |
| A-12 | 3-OCH ₃ | - |
| A-13 | 3-CF ₃ | - |
| A-14 | 3-C ₆ H ₅ | - |
| A-15 | 3-CH ₃ | - |
| A-16 | 4-Cl | - |
| A-17 | 4-F | - |
| A-18 | 4-Br | - |
| A-19 | 4-OCH ₃ | - |
| A-20 | 4-CF ₃ | - |
| A-21 | 4-C ₆ H ₅ | - |
| A-22 | 4-CH ₃ | - |
| A-23 | 2-Cl, 6-Cl | - |
| A-24 | 2-Cl, 5-Cl | - |
| A-25 | 2-Cl, 3-Cl | - |
| A-26 | 2-Cl, 4-Cl | - |
| A-27 | 3-Cl, 4-Cl | - |
| A-28 | 3-Cl, 5-Cl | - |
| A-29 | 2-F, 6-F | - |
| A-30 | 2-F, 5-F | - |
| A-31 | 2-F, 3-F | - |
| A-32 | 2-F, 4-F | - |
| A-33 | 3-F, 4-F | - |
| A-34 | 3-F, 5-F | - |
| A-35 | 2-F, 6-Cl | - |
| A-36 | 2-F, 5-Cl | - |
| A-37 | 2-F, 3-Cl | - |
| A-38 | 2-F, 4-Cl | - |
| A-39 | 3-F, 4-Cl | - |
| A-40 | 3-F, 5-Cl | - |
| A-41 | 2-Cl, 6-F | - |
| A-42 | 2-Cl, 5-F | - |
| A-43 | 2-Cl, 3-F | - |
| A-44 | 2-Cl, 4-F | - |
| A-45 | 3-Cl, 4-F | - |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|------|---|-----------|
| A-46 | 3-OCH ₃ , 5-Cl | - |
| A-47 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | - |
| A-48 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | - |
| A-49 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | - |
| A-50 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | - |
| A-51 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | - |
| A-52 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | - |
| A-53 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | - |
| A-54 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | - |
| A-55 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | - |
| A-56 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | - |
| A-57 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | - |
| A-58 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | - |
| A-59 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | - |
| A-60 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | - |
| A-61 | 2-Cl | 2-Cl |
| A-62 | 2-F | 2-Cl |
| A-63 | 2-Br | 2-Cl |
| A-64 | 2-OCH ₃ | 2-Cl |
| A-65 | 2-CF ₃ | 2-Cl |
| A-66 | 2-C ₆ H ₅ | 2-Cl |
| A-67 | 2-CH ₃ | 2-Cl |
| A-68 | 3-Cl | 2-Cl |
| A-69 | 3-F | 2-Cl |
| A-70 | 3-Br | 2-Cl |
| A-71 | 3-OCH ₃ | 2-Cl |
| A-72 | 3-CF ₃ | 2-Cl |
| A-73 | 3-C ₆ H ₅ | 2-Cl |
| A-74 | 3-CH ₃ | 2-Cl |
| A-75 | 4-Cl | 2-Cl |
| A-76 | 4-F | 2-Cl |
| A-77 | 4-Br | 2-Cl |
| A-78 | 4-OCH ₃ | 2-Cl |
| A-79 | 4-CF ₃ | 2-Cl |
| A-80 | 4-C ₆ H ₅ | 2-Cl |
| A-81 | 4-CH ₃ | 2-Cl |
| A-82 | 2-Cl, 6-Cl | 2-Cl |
| A-83 | 2-Cl, 5-Cl | 2-Cl |

| | (R ¹) _n | (R ²) _m |
|-------|---|--------------------------------|
| A-84 | 2-Cl, 3-Cl | 2-Cl |
| A-85 | 2-Cl, 4-Cl | 2-Cl |
| A-86 | 3-Cl, 4-Cl | 2-Cl |
| A-87 | 3-Cl, 5-Cl | 2-Cl |
| A-88 | 2-F, 6-F | 2-Cl |
| A-89 | 2-F, 5-F | 2-Cl |
| A-90 | 2-F, 3-F | 2-Cl |
| A-91 | 2-F, 4-F | 2-Cl |
| A-92 | 3-F, 4-F | 2-Cl |
| A-93 | 3-F, 5-F | 2-Cl |
| A-94 | 2-F, 6-Cl | 2-Cl |
| A-95 | 2-F, 5-Cl | 2-Cl |
| A-96 | 2-F, 3-Cl | 2-Cl |
| A-97 | 2-F, 4-Cl | 2-Cl |
| A-98 | 3-F, 4-Cl | 2-Cl |
| A-99 | 3-F, 5-Cl | 2-Cl |
| A-100 | 2-Cl, 6-F | 2-Cl |
| A-101 | 2-Cl, 5-F | 2-Cl |
| A-102 | 2-Cl, 3-F | 2-Cl |
| A-103 | 2-Cl, 4-F | 2-Cl |
| A-104 | 3-Cl, 4-F | 2-Cl |
| A-105 | 3-OCH ₃ , 5-Cl | 2-Cl |
| A-106 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | 2-Cl |
| A-107 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | 2-Cl |
| A-108 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | 2-Cl |
| A-109 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | 2-Cl |
| A-110 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | 2-Cl |
| A-111 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | 2-Cl |
| A-112 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | 2-Cl |
| A-113 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | 2-Cl |
| A-114 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 2-Cl |
| A-115 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 2-Cl |
| A-116 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | 2-Cl |
| A-117 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | 2-Cl |
| A-118 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 2-Cl |
| A-119 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 2-Cl |
| A-120 | - | 2-F |
| A-121 | 2-Cl | 2-F |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---------------------------------|-----------|
| A-122 | 2-F | 2-F |
| A-123 | 2-Br | 2-F |
| A-124 | 2-OCH ₃ | 2-F |
| A-125 | 2-CF ₃ | 2-F |
| A-126 | 2-C ₆ H ₅ | 2-F |
| A-127 | 2-CH ₃ | 2-F |
| A-128 | 3-Cl | 2-F |
| A-129 | 3-F | 2-F |
| A-130 | 3-Br | 2-F |
| A-131 | 3-OCH ₃ | 2-F |
| A-132 | 3-CF ₃ | 2-F |
| A-133 | 3-C ₆ H ₅ | 2-F |
| A-134 | 3-CH ₃ | 2-F |
| A-135 | 4-Cl | 2-F |
| A-136 | 4-F | 2-F |
| A-137 | 4-Br | 2-F |
| A-138 | 4-OCH ₃ | 2-F |
| A-139 | 4-CF ₃ | 2-F |
| A-140 | 4-C ₆ H ₅ | 2-F |
| A-141 | 4-CH ₃ | 2-F |
| A-142 | 2-Cl, 6-Cl | 2-F |
| A-143 | 2-Cl, 5-Cl | 2-F |
| A-144 | 2-Cl, 3-Cl | 2-F |
| A-145 | 2-Cl, 4-Cl | 2-F |
| A-146 | 3-Cl, 4-Cl | 2-F |
| A-147 | 3-Cl, 5-Cl | 2-F |
| A-148 | 2-F, 6-F | 2-F |
| A-149 | 2-F, 5-F | 2-F |
| A-150 | 2-F, 3-F | 2-F |
| A-151 | 2-F, 4-F | 2-F |
| A-152 | 3-F, 4-F | 2-F |
| A-153 | 3-F, 5-F | 2-F |
| A-154 | 2-F, 6-Cl | 2-F |
| A-155 | 2-F, 5-Cl | 2-F |
| A-156 | 2-F, 3-Cl | 2-F |
| A-157 | 2-F, 4-Cl | 2-F |
| A-158 | 3-F, 4-Cl | 2-F |
| A-159 | 3-F, 5-Cl | 2-F |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---|-----------|
| A-160 | 2-Cl, 6-F | 2-F |
| A-161 | 2-Cl, 5-F | 2-F |
| A-162 | 2-Cl, 3-F | 2-F |
| A-163 | 2-Cl, 4-F | 2-F |
| A-164 | 3-Cl, 4-F | 2-F |
| A-165 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | 2-F |
| A-166 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | 2-F |
| A-167 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | 2-F |
| A-168 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | 2-F |
| A-169 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | 2-F |
| A-170 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | 2-F |
| A-171 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | 2-F |
| A-172 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | 2-F |
| A-173 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 2-F |
| A-174 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 2-F |
| A-175 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | 2-F |
| A-176 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | 2-F |
| A-177 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 2-F |
| A-178 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 2-F |
| A-179 | - | 2-Br |
| A-180 | 2-Cl | 2-Br |
| A-181 | 2-F | 2-Br |
| A-182 | 2-Br | 2-Br |
| A-183 | 2-OCH ₃ | 2-Br |
| A-184 | 2-CF ₃ | 2-Br |
| A-185 | 2-C ₆ H ₅ | 2-Br |
| A-186 | 2-CH ₃ | 2-Br |
| A-187 | 3-Cl | 2-Br |
| A-188 | 3-F | 2-Br |
| A-189 | 3-Br | 2-Br |
| A-190 | 3-OCH ₃ | 2-Br |
| A-191 | 3-CF ₃ | 2-Br |
| A-192 | 3-C ₆ H ₅ | 2-Br |
| A-193 | 3-CH ₃ | 2-Br |
| A-194 | 4-Cl | 2-Br |
| A-195 | 4-F | 2-Br |
| A-196 | 4-Br | 2-Br |
| A-197 | 4-OCH ₃ | 2-Br |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---|-----------|
| A-198 | 4-CF ₃ | 2-Br |
| A-199 | 4-C ₆ H ₅ | 2-Br |
| A-200 | 4-CH ₃ | 2-Br |
| A-201 | 2-Cl, 6-Cl | 2-Br |
| A-202 | 2-Cl, 5-Cl | 2-Br |
| A-203 | 2-Cl, 3-Cl | 2-Br |
| A-204 | 2-Cl, 4-Cl | 2-Br |
| A-205 | 3-Cl, 4-Cl | 2-Br |
| A-206 | 3-Cl, 5-Cl | 2-Br |
| A-207 | 2-F, 6-F | 2-Br |
| A-208 | 2-F, 5-F | 2-Br |
| A-209 | 2-F, 3-F | 2-Br |
| A-210 | 2-F, 4-F | 2-Br |
| A-211 | 3-F, 4-F | 2-Br |
| A-212 | 3-F, 5-F | 2-Br |
| A-213 | 2-F, 6-Cl | 2-Br |
| A-214 | 2-F, 5-Cl | 2-Br |
| A-215 | 2-F, 3-Cl | 2-Br |
| A-216 | 2-F, 4-Cl | 2-Br |
| A-217 | 3-F, 4-Cl | 2-Br |
| A-218 | 3-F, 5-Cl | 2-Br |
| A-219 | 2-Cl, 6-F | 2-Br |
| A-220 | 2-Cl, 5-F | 2-Br |
| A-221 | 2-Cl, 3-F | 2-Br |
| A-222 | 2-Cl, 4-F | 2-Br |
| A-223 | 3-Cl, 4-F | 2-Br |
| A-224 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | 2-Br |
| A-225 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | 2-Br |
| A-226 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | 2-Br |
| A-227 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | 2-Br |
| A-228 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | 2-Br |
| A-229 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | 2-Br |
| A-230 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | 2-Br |
| A-231 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | 2-Br |
| A-232 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 2-Br |
| A-233 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 2-Br |
| A-234 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | 2-Br |
| A-235 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | 2-Br |

| | (R ¹) _n | (R ²) _m |
|-------|---|--------------------------------|
| A-236 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 2-Br |
| A-237 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 2-Br |
| A-238 | - | 2-CH ₃ |
| A-239 | 2-Cl | 2-CH ₃ |
| A-240 | 2-F | 2-CH ₃ |
| A-241 | 2-Br | 2-CH ₃ |
| A-242 | 2-OCH ₃ | 2-CH ₃ |
| A-243 | 2-CF ₃ | 2-CH ₃ |
| A-244 | 2-C ₆ H ₅ | 2-CH ₃ |
| A-245 | 2-CH ₃ | 2-CH ₃ |
| A-246 | 3-Cl | 2-CH ₃ |
| A-247 | 3-F | 2-CH ₃ |
| A-248 | 3-Br | 2-CH ₃ |
| A-249 | 3-OCH ₃ | 2-CH ₃ |
| A-250 | 3-CF ₃ | 2-CH ₃ |
| A-251 | 3-C ₆ H ₅ | 2-CH ₃ |
| A-252 | 3-CH ₃ | 2-CH ₃ |
| A-253 | 4-Cl | 2-CH ₃ |
| A-254 | 4-F | 2-CH ₃ |
| A-255 | 4-Br | 2-CH ₃ |
| A-256 | 4-OCH ₃ | 2-CH ₃ |
| A-257 | 4-CF ₃ | 2-CH ₃ |
| A-258 | 4-C ₆ H ₅ | 2-CH ₃ |
| A-259 | 4-CH ₃ | 2-CH ₃ |
| A-260 | 2-Cl, 6-Cl | 2-CH ₃ |
| A-261 | 2-Cl, 5-Cl | 2-CH ₃ |
| A-262 | 2-Cl, 3-Cl | 2-CH ₃ |
| A-263 | 2-Cl, 4-Cl | 2-CH ₃ |
| A-264 | 3-Cl, 4-Cl | 2-CH ₃ |
| A-265 | 3-Cl, 5-Cl | 2-CH ₃ |
| A-266 | 2-F, 6-F | 2-CH ₃ |
| A-267 | 2-F, 5-F | 2-CH ₃ |
| A-268 | 2-F, 3-F | 2-CH ₃ |
| A-269 | 2-F, 4-F | 2-CH ₃ |
| A-270 | 3-F, 4-F | 2-CH ₃ |
| A-271 | 3-F, 5-F | 2-CH ₃ |
| A-272 | 2-F, 6-Cl | 2-CH ₃ |
| A-273 | 2-F, 5-Cl | 2-CH ₃ |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---|-------------------|
| A-274 | 2-F, 3-Cl | 2-CH ₃ |
| A-275 | 2-F, 4-Cl | 2-CH ₃ |
| A-276 | 3-F, 4-Cl | 2-CH ₃ |
| A-277 | 3-F, 5-Cl | 2-CH ₃ |
| A-278 | 2-Cl, 6-F | 2-CH ₃ |
| A-279 | 2-Cl, 5-F | 2-CH ₃ |
| A-280 | 2-Cl, 3-F | 2-CH ₃ |
| A-281 | 2-Cl, 4-F | 2-CH ₃ |
| A-282 | 3-Cl, 4-F | 2-CH ₃ |
| A-283 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | 2-CH ₃ |
| A-284 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | 2-CH ₃ |
| A-285 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | 2-CH ₃ |
| A-286 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | 2-CH ₃ |
| A-287 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | 2-CH ₃ |
| A-288 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | 2-CH ₃ |
| A-289 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | 2-CH ₃ |
| A-290 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | 2-CH ₃ |
| A-291 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 2-CH ₃ |
| A-292 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 2-CH ₃ |
| A-293 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | 2-CH ₃ |
| A-294 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | 2-CH ₃ |
| A-295 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 2-CH ₃ |
| A-296 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 2-CH ₃ |
| A-297 | - | 2-CF ₃ |
| A-298 | 2-Cl | 2-CF ₃ |
| A-299 | 2-F | 2-CF ₃ |
| A-300 | 2-Br | 2-CF ₃ |
| A-301 | 2-OCH ₃ | 2-CF ₃ |
| A-302 | 2-CF ₃ | 2-CF ₃ |
| A-303 | 2-C ₆ H ₅ | 2-CF ₃ |
| A-304 | 2-CH ₃ | 2-CF ₃ |
| A-305 | 3-Cl | 2-CF ₃ |
| A-306 | 3-F | 2-CF ₃ |
| A-307 | 3-Br | 2-CF ₃ |
| A-308 | 3-OCH ₃ | 2-CF ₃ |
| A-309 | 3-CF ₃ | 2-CF ₃ |
| A-310 | 3-C ₆ H ₅ | 2-CF ₃ |
| A-311 | 3-CH ₃ | 2-CF ₃ |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---------------------------------|-------------------|
| A-312 | 4-Cl | 2-CF ₃ |
| A-313 | 4-F | 2-CF ₃ |
| A-314 | 4-Br | 2-CF ₃ |
| A-315 | 4-OCH ₃ | 2-CF ₃ |
| A-316 | 4-CF ₃ | 2-CF ₃ |
| A-317 | 4-C ₆ H ₅ | 2-CF ₃ |
| A-318 | 4-CH ₃ | 2-CF ₃ |
| A-319 | 2-Cl, 6-Cl | 2-CF ₃ |
| A-320 | 2-Cl, 5-Cl | 2-CF ₃ |
| A-321 | 2-Cl, 3-Cl | 2-CF ₃ |
| A-322 | 2-Cl, 4-Cl | 2-CF ₃ |
| A-323 | 3-Cl, 4-Cl | 2-CF ₃ |
| A-324 | 3-Cl, 5-Cl | 2-CF ₃ |
| A-325 | 2-F, 6-F | 2-CF ₃ |
| A-326 | 2-F, 5-F | 2-CF ₃ |
| A-327 | 2-F, 3-F | 2-CF ₃ |
| A-328 | 2-F, 4-F | 2-CF ₃ |
| A-329 | 3-F, 4-F | 2-CF ₃ |
| A-330 | 3-F, 5-F | 2-CF ₃ |
| A-331 | 2-F, 6-Cl | 2-CF ₃ |
| A-332 | 2-F, 5-Cl | 2-CF ₃ |
| A-333 | 2-F, 3-Cl | 2-CF ₃ |
| A-334 | 2-F, 4-Cl | 2-CF ₃ |
| A-335 | 3-F, 4-Cl | 2-CF ₃ |
| A-336 | 3-F, 5-Cl | 2-CF ₃ |
| A-337 | 2-Cl, 6-F | 2-CF ₃ |
| A-338 | 2-Cl, 5-F | 2-CF ₃ |
| A-339 | 2-Cl, 3-F | 2-CF ₃ |
| A-340 | 2-Cl, 4-F | 2-CF ₃ |
| A-341 | 3-Cl, 4-F | 2-CF ₃ |
| A-342 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | 2-CF ₃ |
| A-343 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | 2-CF ₃ |
| A-344 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | 2-CF ₃ |
| A-345 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | 2-CF ₃ |
| A-346 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | 2-CF ₃ |
| A-347 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | 2-CF ₃ |
| A-348 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | 2-CF ₃ |
| A-349 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | 2-CF ₃ |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---|--------------------|
| A-350 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 2-CF ₃ |
| A-351 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 2-CF ₃ |
| A-352 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | 2-CF ₃ |
| A-353 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | 2-CF ₃ |
| A-354 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 2-CF ₃ |
| A-355 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 2-CF ₃ |
| A-356 | - | 2-OCH ₃ |
| A-357 | 2-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-358 | 2-F | 2-OCH ₃ |
| A-359 | 2-Br | 2-OCH ₃ |
| A-360 | 2-OCH ₃ | 2-OCH ₃ |
| A-361 | 2-CF ₃ | 2-OCH ₃ |
| A-362 | 2-C ₆ H ₅ | 2-OCH ₃ |
| A-363 | 2-CH ₃ | 2-OCH ₃ |
| A-364 | 3-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-365 | 3-F | 2-OCH ₃ |
| A-366 | 3-Br | 2-OCH ₃ |
| A-367 | 3-OCH ₃ | 2-OCH ₃ |
| A-368 | 3-CF ₃ | 2-OCH ₃ |
| A-369 | 3-C ₆ H ₅ | 2-OCH ₃ |
| A-370 | 3-CH ₃ | 2-OCH ₃ |
| A-371 | 4-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-372 | 4-F | 2-OCH ₃ |
| A-373 | 4-Br | 2-OCH ₃ |
| A-374 | 4-OCH ₃ | 2-OCH ₃ |
| A-375 | 4-CF ₃ | 2-OCH ₃ |
| A-376 | 4-C ₆ H ₅ | 2-OCH ₃ |
| A-377 | 4-CH ₃ | 2-OCH ₃ |
| A-378 | 2-Cl, 6-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-379 | 2-Cl, 5-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-380 | 2-Cl, 3-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-381 | 2-Cl, 4-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-382 | 3-Cl, 4-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-383 | 3-Cl, 5-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-384 | 2-F, 6-F | 2-OCH ₃ |
| A-385 | 2-F, 5-F | 2-OCH ₃ |
| A-386 | 2-F, 3-F | 2-OCH ₃ |
| A-387 | 2-F, 4-F | 2-OCH ₃ |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---|--------------------|
| A-388 | 3-F, 4-F | 2-OCH ₃ |
| A-389 | 3-F, 5-F | 2-OCH ₃ |
| A-390 | 2-F, 6-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-391 | 2-F, 5-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-392 | 2-F, 3-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-393 | 2-F, 4-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-394 | 3-F, 4-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-395 | 3-F, 5-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-396 | 2-Cl, 6-F | 2-OCH ₃ |
| A-397 | 2-Cl, 5-F | 2-OCH ₃ |
| A-398 | 2-Cl, 3-F | 2-OCH ₃ |
| A-399 | 2-Cl, 4-F | 2-OCH ₃ |
| A-400 | 3-Cl, 4-F | 2-OCH ₃ |
| A-401 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-402 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-403 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-404 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-405 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-406 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-407 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-408 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | 2-OCH ₃ |
| A-409 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 2-OCH ₃ |
| A-410 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 2-OCH ₃ |
| A-411 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | 2-OCH ₃ |
| A-412 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | 2-OCH ₃ |
| A-413 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 2-OCH ₃ |
| A-414 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 2-OCH ₃ |
| A-415 | - | 3-Cl |
| A-416 | 2-Cl | 3-Cl |
| A-417 | 2-F | 3-Cl |
| A-418 | 2-Br | 3-Cl |
| A-419 | 2-OCH ₃ | 3-Cl |
| A-420 | 2-CF ₃ | 3-Cl |
| A-421 | 2-C ₆ H ₅ | 3-Cl |
| A-422 | 2-CH ₃ | 3-Cl |
| A-423 | 3-Cl | 3-Cl |
| A-424 | 3-F | 3-Cl |
| A-425 | 3-Br | 3-Cl |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---------------------------------|-----------|
| A-426 | 3-OCH ₃ | 3-Cl |
| A-427 | 3-CF ₃ | 3-Cl |
| A-428 | 3-C ₆ H ₅ | 3-Cl |
| A-429 | 3-CH ₃ | 3-Cl |
| A-430 | 4-Cl | 3-Cl |
| A-431 | 4-F | 3-Cl |
| A-432 | 4-Br | 3-Cl |
| A-433 | 4-OCH ₃ | 3-Cl |
| A-434 | 4-CF ₃ | 3-Cl |
| A-435 | 4-C ₆ H ₅ | 3-Cl |
| A-436 | 4-CH ₃ | 3-Cl |
| A-437 | 2-Cl, 6-Cl | 3-Cl |
| A-438 | 2-Cl, 5-Cl | 3-Cl |
| A-439 | 2-Cl, 3-Cl | 3-Cl |
| A-440 | 2-Cl, 4-Cl | 3-Cl |
| A-441 | 3-Cl, 4-Cl | 3-Cl |
| A-442 | 3-Cl, 5-Cl | 3-Cl |
| A-443 | 2-F, 6-F | 3-Cl |
| A-444 | 2-F, 5-F | 3-Cl |
| A-445 | 2-F, 3-F | 3-Cl |
| A-446 | 2-F, 4-F | 3-Cl |
| A-447 | 3-F, 4-F | 3-Cl |
| A-448 | 3-F, 5-F | 3-Cl |
| A-449 | 2-F, 6-Cl | 3-Cl |
| A-450 | 2-F, 5-Cl | 3-Cl |
| A-451 | 2-F, 3-Cl | 3-Cl |
| A-452 | 2-F, 4-Cl | 3-Cl |
| A-453 | 3-F, 4-Cl | 3-Cl |
| A-454 | 3-F, 5-Cl | 3-Cl |
| A-455 | 2-Cl, 6-F | 3-Cl |
| A-456 | 2-Cl, 5-F | 3-Cl |
| A-457 | 2-Cl, 3-F | 3-Cl |
| A-458 | 2-Cl, 4-F | 3-Cl |
| A-459 | 3-Cl, 4-F | 3-Cl |
| A-460 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | 3-Cl |
| A-461 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | 3-Cl |
| A-462 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | 3-Cl |
| A-463 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | 3-Cl |

| | (R ¹) _n | (R ²) _m |
|-------|---|--------------------------------|
| A-464 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | 3-Cl |
| A-465 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | 3-Cl |
| A-466 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | 3-Cl |
| A-467 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | 3-Cl |
| A-468 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 3-Cl |
| A-469 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 3-Cl |
| A-470 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | 3-Cl |
| A-471 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | 3-Cl |
| A-472 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 3-Cl |
| A-473 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 3-Cl |
| A-474 | - | 3-Br |
| A-475 | 2-Cl | 3-Br |
| A-476 | 2-F | 3-Br |
| A-477 | 2-Br | 3-Br |
| A-478 | 2-OCH ₃ | 3-Br |
| A-479 | 2-CF ₃ | 3-Br |
| A-480 | 2-C ₆ H ₅ | 3-Br |
| A-481 | 2-CH ₃ | 3-Br |
| A-482 | 3-Cl | 3-Br |
| A-483 | 3-F | 3-Br |
| A-484 | 3-Br | 3-Br |
| A-485 | 3-OCH ₃ | 3-Br |
| A-486 | 3-CF ₃ | 3-Br |
| A-487 | 3-C ₆ H ₅ | 3-Br |
| A-488 | 3-CH ₃ | 3-Br |
| A-489 | 4-Cl | 3-Br |
| A-490 | 4-F | 3-Br |
| A-491 | 4-Br | 3-Br |
| A-492 | 4-OCH ₃ | 3-Br |
| A-493 | 4-CF ₃ | 3-Br |
| A-494 | 4-C ₆ H ₅ | 3-Br |
| A-495 | 4-CH ₃ | 3-Br |
| A-496 | 2-Cl, 6-Cl | 3-Br |
| A-497 | 2-Cl, 5-Cl | 3-Br |
| A-498 | 2-Cl, 3-Cl | 3-Br |
| A-499 | 2-Cl, 4-Cl | 3-Br |
| A-500 | 3-Cl, 4-Cl | 3-Br |
| A-501 | 3-Cl, 5-Cl | 3-Br |

| | (R ¹) _n | (R ²) _m |
|-------|---|--------------------------------|
| A-502 | 2-F, 6-F | 3-Br |
| A-503 | 2-F, 5-F | 3-Br |
| A-504 | 2-F, 3-F | 3-Br |
| A-505 | 2-F, 4-F | 3-Br |
| A-506 | 3-F, 4-F | 3-Br |
| A-507 | 3-F, 5-F | 3-Br |
| A-508 | 2-F, 6-Cl | 3-Br |
| A-509 | 2-F, 5-Cl | 3-Br |
| A-510 | 2-F, 3-Cl | 3-Br |
| A-511 | 2-F, 4-Cl | 3-Br |
| A-512 | 3-F, 4-Cl | 3-Br |
| A-513 | 3-F, 5-Cl | 3-Br |
| A-514 | 2-Cl, 6-F | 3-Br |
| A-515 | 2-Cl, 5-F | 3-Br |
| A-516 | 2-Cl, 3-F | 3-Br |
| A-517 | 2-Cl, 4-F | 3-Br |
| A-518 | 3-Cl, 4-F | 3-Br |
| A-519 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | 3-Br |
| A-520 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | 3-Br |
| A-521 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | 3-Br |
| A-522 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | 3-Br |
| A-523 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | 3-Br |
| A-524 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | 3-Br |
| A-525 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | 3-Br |
| A-526 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | 3-Br |
| A-527 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 3-Br |
| A-528 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 3-Br |
| A-529 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | 3-Br |
| A-530 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | 3-Br |
| A-531 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 3-Br |
| A-532 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 3-Br |
| A-533 | - | 3-F |
| A-534 | 2-Cl | 3-F |
| A-535 | 2-F | 3-F |
| A-536 | 2-Br | 3-F |
| A-537 | 2-OCH ₃ | 3-F |
| A-538 | 2-CF ₃ | 3-F |
| A-539 | 2-C ₆ H ₅ | 3-F |

| | (R ¹) _n | (R ²) _m |
|-------|---------------------------------|--------------------------------|
| A-540 | 2-CH ₃ | 3-F |
| A-541 | 3-Cl | 3-F |
| A-542 | 3-F | 3-F |
| A-543 | 3-Br | 3-F |
| A-544 | 3-OCH ₃ | 3-F |
| A-545 | 3-CF ₃ | 3-F |
| A-546 | 3-C ₆ H ₅ | 3-F |
| A-547 | 3-CH ₃ | 3-F |
| A-548 | 4-Cl | 3-F |
| A-549 | 4-F | 3-F |
| A-550 | 4-Br | 3-F |
| A-551 | 4-OCH ₃ | 3-F |
| A-552 | 4-CF ₃ | 3-F |
| A-553 | 4-C ₆ H ₅ | 3-F |
| A-554 | 4-CH ₃ | 3-F |
| A-555 | 2-Cl, 6-Cl | 3-F |
| A-556 | 2-Cl, 5-Cl | 3-F |
| A-557 | 2-Cl, 3-Cl | 3-F |
| A-558 | 2-Cl, 4-Cl | 3-F |
| A-559 | 3-Cl, 4-Cl | 3-F |
| A-560 | 3-Cl, 5-Cl | 3-F |
| A-561 | 2-F, 6-F | 3-F |
| A-562 | 2-F, 5-F | 3-F |
| A-563 | 2-F, 3-F | 3-F |
| A-564 | 2-F, 4-F | 3-F |
| A-565 | 3-F, 4-F | 3-F |
| A-566 | 3-F, 5-F | 3-F |
| A-567 | 2-F, 6-Cl | 3-F |
| A-568 | 2-F, 5-Cl | 3-F |
| A-569 | 2-F, 3-Cl | 3-F |
| A-570 | 2-F, 4-Cl | 3-F |
| A-571 | 3-F, 4-Cl | 3-F |
| A-572 | 3-F, 5-Cl | 3-F |
| A-573 | 2-Cl, 6-F | 3-F |
| A-574 | 2-Cl, 5-F | 3-F |
| A-575 | 2-Cl, 3-F | 3-F |
| A-576 | 2-Cl, 4-F | 3-F |
| A-577 | 3-Cl, 4-F | 3-F |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---|-------------------|
| A-578 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | 3-F |
| A-579 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | 3-F |
| A-580 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | 3-F |
| A-581 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | 3-F |
| A-582 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | 3-F |
| A-583 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | 3-F |
| A-584 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | 3-F |
| A-585 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | 3-F |
| A-586 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 3-F |
| A-587 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 3-F |
| A-588 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | 3-F |
| A-589 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | 3-F |
| A-590 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 3-F |
| A-591 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 3-F |
| A-592 | - | 3-F |
| A-593 | 2-Cl | 3-CH ₃ |
| A-594 | 2-F | 3-CH ₃ |
| A-595 | 2-Br | 3-CH ₃ |
| A-596 | 2-OCH ₃ | 3-CH ₃ |
| A-597 | 2-CF ₃ | 3-CH ₃ |
| A-598 | 2-C ₆ H ₅ | 3-CH ₃ |
| A-599 | 2-CH ₃ | 3-CH ₃ |
| A-600 | 3-Cl | 3-CH ₃ |
| A-601 | 3-F | 3-CH ₃ |
| A-602 | 3-Br | 3-CH ₃ |
| A-603 | 3-OCH ₃ | 3-CH ₃ |
| A-604 | 3-CF ₃ | 3-CH ₃ |
| A-605 | 3-C ₆ H ₅ | 3-CH ₃ |
| A-606 | 3-CH ₃ | 3-CH ₃ |
| A-607 | 4-Cl | 3-CH ₃ |
| A-608 | 4-F | 3-CH ₃ |
| A-609 | 4-Br | 3-CH ₃ |
| A-610 | 4-OCH ₃ | 3-CH ₃ |
| A-611 | 4-CF ₃ | 3-CH ₃ |
| A-612 | 4-C ₆ H ₅ | 3-CH ₃ |
| A-613 | 4-CH ₃ | 3-CH ₃ |
| A-614 | 2-Cl, 6-Cl | 3-CH ₃ |
| A-615 | 2-Cl, 5-Cl | 3-CH ₃ |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---|-------------------|
| A-616 | 2-Cl, 3-Cl | 3-CH ₃ |
| A-617 | 2-Cl, 4-Cl | 3-CH ₃ |
| A-618 | 3-Cl, 4-Cl | 3-CH ₃ |
| A-619 | 3-Cl, 5-Cl | 3-CH ₃ |
| A-620 | 2-F, 6-F | 3-CH ₃ |
| A-621 | 2-F, 5-F | 3-CH ₃ |
| A-622 | 2-F, 3-F | 3-CH ₃ |
| A-623 | 2-F, 4-F | 3-CH ₃ |
| A-624 | 3-F, 4-F | 3-CH ₃ |
| A-625 | 3-F, 5-F | 3-CH ₃ |
| A-626 | 2-F, 6-Cl | 3-CH ₃ |
| A-627 | 2-F, 5-Cl | 3-CH ₃ |
| A-628 | 2-F, 3-Cl | 3-CH ₃ |
| A-629 | 2-F, 4-Cl | 3-CH ₃ |
| A-630 | 3-F, 4-Cl | 3-CH ₃ |
| A-631 | 3-F, 5-Cl | 3-CH ₃ |
| A-632 | 2-Cl, 6-F | 3-CH ₃ |
| A-633 | 2-Cl, 5-F | 3-CH ₃ |
| A-634 | 2-Cl, 3-F | 3-CH ₃ |
| A-635 | 2-Cl, 4-F | 3-CH ₃ |
| A-636 | 3-Cl, 4-F | 3-CH ₃ |
| A-637 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | 3-CH ₃ |
| A-638 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | 3-CH ₃ |
| A-639 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | 3-CH ₃ |
| A-640 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | 3-CH ₃ |
| A-641 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | 3-CH ₃ |
| A-642 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | 3-CH ₃ |
| A-643 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | 3-CH ₃ |
| A-644 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | 3-CH ₃ |
| A-645 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 3-CH ₃ |
| A-646 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 3-CH ₃ |
| A-647 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | 3-CH ₃ |
| A-648 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | 3-CH ₃ |
| A-649 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 3-CH ₃ |
| A-650 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 3-CH ₃ |
| A-651 | - | 3-CF ₃ |
| A-652 | 2-Cl | 3-CF ₃ |
| A-653 | 2-F | 3-CF ₃ |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---------------------------------|-------------------|
| A-654 | 2-Br | 3-CF ₃ |
| A-655 | 2-OCH ₃ | 3-CF ₃ |
| A-656 | 2-CF ₃ | 3-CF ₃ |
| A-657 | 2-C ₆ H ₅ | 3-CF ₃ |
| A-658 | 2-CH ₃ | 3-CF ₃ |
| A-659 | 3-Cl | 3-CF ₃ |
| A-660 | 3-F | 3-CF ₃ |
| A-661 | 3-Br | 3-CF ₃ |
| A-662 | 3-OCH ₃ | 3-CF ₃ |
| A-663 | 3-CF ₃ | 3-CF ₃ |
| A-664 | 3-C ₆ H ₅ | 3-CF ₃ |
| A-665 | 3-CH ₃ | 3-CF ₃ |
| A-666 | 4-Cl | 3-CF ₃ |
| A-667 | 4-F | 3-CF ₃ |
| A-668 | 4-Br | 3-CF ₃ |
| A-669 | 4-OCH ₃ | 3-CF ₃ |
| A-670 | 4-CF ₃ | 3-CF ₃ |
| A-671 | 4-C ₆ H ₅ | 3-CF ₃ |
| A-672 | 4-CH ₃ | 3-CF ₃ |
| A-673 | 2-Cl, 6-Cl | 3-CF ₃ |
| A-674 | 2-Cl, 5-Cl | 3-CF ₃ |
| A-675 | 2-Cl, 3-Cl | 3-CF ₃ |
| A-676 | 2-Cl, 4-Cl | 3-CF ₃ |
| A-677 | 3-Cl, 4-Cl | 3-CF ₃ |
| A-678 | 3-Cl, 5-Cl | 3-CF ₃ |
| A-679 | 2-F, 6-F | 3-CF ₃ |
| A-680 | 2-F, 5-F | 3-CF ₃ |
| A-681 | 2-F, 3-F | 3-CF ₃ |
| A-682 | 2-F, 4-F | 3-CF ₃ |
| A-683 | 3-F, 4-F | 3-CF ₃ |
| A-684 | 3-F, 5-F | 3-CF ₃ |
| A-685 | 2-F, 6-Cl | 3-CF ₃ |
| A-686 | 2-F, 5-Cl | 3-CF ₃ |
| A-687 | 2-F, 3-Cl | 3-CF ₃ |
| A-688 | 2-F, 4-Cl | 3-CF ₃ |
| A-689 | 3-F, 4-Cl | 3-CF ₃ |
| A-690 | 3-F, 5-Cl | 3-CF ₃ |
| A-691 | 2-Cl, 6-F | 3-CF ₃ |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---|--------------------|
| A-692 | 2-Cl, 5-F | 3-CF ₃ |
| A-693 | 2-Cl, 3-F | 3-CF ₃ |
| A-694 | 2-Cl, 4-F | 3-CF ₃ |
| A-695 | 3-Cl, 4-F | 3-CF ₃ |
| A-696 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | 3-CF ₃ |
| A-697 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | 3-CF ₃ |
| A-698 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | 3-CF ₃ |
| A-699 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | 3-CF ₃ |
| A-700 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | 3-CF ₃ |
| A-701 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | 3-CF ₃ |
| A-702 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | 3-CF ₃ |
| A-703 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | 3-CF ₃ |
| A-704 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 3-CF ₃ |
| A-705 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 3-CF ₃ |
| A-706 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | 3-CF ₃ |
| A-707 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | 3-CF ₃ |
| A-708 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 3-CF ₃ |
| A-709 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 3-CF ₃ |
| A-710 | - | 3-OCH ₃ |
| A-711 | 2-Cl | 3-OCH ₃ |
| A-712 | 2-F | 3-OCH ₃ |
| A-713 | 2-Br | 3-OCH ₃ |
| A-714 | 2-OCH ₃ | 3-OCH ₃ |
| A-715 | 2-CF ₃ | 3-OCH ₃ |
| A-716 | 2-C ₆ H ₅ | 3-OCH ₃ |
| A-717 | 2-CH ₃ | 3-OCH ₃ |
| A-718 | 3-Cl | 3-OCH ₃ |
| A-719 | 3-F | 3-OCH ₃ |
| A-720 | 3-Br | 3-OCH ₃ |
| A-721 | 3-OCH ₃ | 3-OCH ₃ |
| A-722 | 3-CF ₃ | 3-OCH ₃ |
| A-723 | 3-C ₆ H ₅ | 3-OCH ₃ |
| A-724 | 3-CH ₃ | 3-OCH ₃ |
| A-725 | 4-Cl | 3-OCH ₃ |
| A-726 | 4-F | 3-OCH ₃ |
| A-727 | 4-Br | 3-OCH ₃ |
| A-728 | 4-OCH ₃ | 3-OCH ₃ |
| A-729 | 4-CF ₃ | 3-OCH ₃ |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---|--------------------|
| A-730 | 4-C ₆ H ₅ | 3-OCH ₃ |
| A-731 | 4-CH ₃ | 3-OCH ₃ |
| A-732 | 2-Cl, 6-Cl | 3-OCH ₃ |
| A-733 | 2-Cl, 5-Cl | 3-OCH ₃ |
| A-734 | 2-Cl, 3-Cl | 3-OCH ₃ |
| A-735 | 2-Cl, 4-Cl | 3-OCH ₃ |
| A-736 | 3-Cl, 4-Cl | 3-OCH ₃ |
| A-737 | 3-Cl, 5-Cl | 3-OCH ₃ |
| A-738 | 2-F, 6-F | 3-OCH ₃ |
| A-739 | 2-F, 5-F | 3-OCH ₃ |
| A-740 | 2-F, 3-F | 3-OCH ₃ |
| A-741 | 2-F, 4-F | 3-OCH ₃ |
| A-742 | 3-F, 4-F | 3-OCH ₃ |
| A-743 | 3-F, 5-F | 3-OCH ₃ |
| A-744 | 2-F, 6-Cl | 3-OCH ₃ |
| A-745 | 2-F, 5-Cl | 3-OCH ₃ |
| A-746 | 2-F, 3-Cl | 3-OCH ₃ |
| A-747 | 2-F, 4-Cl | 3-OCH ₃ |
| A-748 | 3-F, 4-Cl | 3-OCH ₃ |
| A-749 | 3-F, 5-Cl | 3-OCH ₃ |
| A-750 | 2-Cl, 6-F | 3-OCH ₃ |
| A-751 | 2-Cl, 5-F | 3-OCH ₃ |
| A-752 | 2-Cl, 3-F | 3-OCH ₃ |
| A-753 | 2-Cl, 4-F | 3-OCH ₃ |
| A-754 | 3-Cl, 4-F | 3-OCH ₃ |
| A-755 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 3-OCH ₃ |
| A-756 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 3-OCH ₃ |
| A-757 | - | 4-Cl |
| A-758 | 2-Cl | 4-Cl |
| A-759 | 2-F | 4-Cl |
| A-760 | 2-Br | 4-Cl |
| A-761 | 2-OCH ₃ | 4-Cl |
| A-762 | 2-CF ₃ | 4-Cl |
| A-763 | 2-C ₆ H ₅ | 4-Cl |
| A-764 | 2-CH ₃ | 4-Cl |
| A-765 | 3-Cl | 4-Cl |
| A-766 | 3-F | 4-Cl |
| A-767 | 3-Br | 4-Cl |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---------------------------------|-----------|
| A-768 | 3-OCH ₃ | 4-Cl |
| A-769 | 3-CF ₃ | 4-Cl |
| A-770 | 3-C ₆ H ₅ | 4-Cl |
| A-771 | 3-CH ₃ | 4-Cl |
| A-772 | 4-Cl | 4-Cl |
| A-773 | 4-F | 4-Cl |
| A-774 | 4-Br | 4-Cl |
| A-775 | 4-OCH ₃ | 4-Cl |
| A-776 | 4-CF ₃ | 4-Cl |
| A-777 | 4-C ₆ H ₅ | 4-Cl |
| A-778 | 4-CH ₃ | 4-Cl |
| A-779 | 2-Cl, 6-Cl | 4-Cl |
| A-780 | 2-Cl, 5-Cl | 4-Cl |
| A-781 | 2-Cl, 3-Cl | 4-Cl |
| A-782 | 2-Cl, 4-Cl | 4-Cl |
| A-783 | 3-Cl, 4-Cl | 4-Cl |
| A-784 | 3-Cl, 5-Cl | 4-Cl |
| A-785 | 2-F, 6-F | 4-Cl |
| A-786 | 2-F, 5-F | 4-Cl |
| A-787 | 2-F, 3-F | 4-Cl |
| A-788 | 2-F, 4-F | 4-Cl |
| A-789 | 3-F, 4-F | 4-Cl |
| A-790 | 3-F, 5-F | 4-Cl |
| A-791 | 2-F, 6-Cl | 4-Cl |
| A-792 | 2-F, 5-Cl | 4-Cl |
| A-793 | 2-F, 3-Cl | 4-Cl |
| A-794 | 2-F, 4-Cl | 4-Cl |
| A-795 | 3-F, 4-Cl | 4-Cl |
| A-796 | 3-F, 5-Cl | 4-Cl |
| A-797 | 2-Cl, 6-F | 4-Cl |
| A-798 | 2-Cl, 5-F | 4-Cl |
| A-799 | 2-Cl, 3-F | 4-Cl |
| A-800 | 2-Cl, 4-F | 4-Cl |
| A-801 | 3-Cl, 4-F | 4-Cl |
| A-802 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | 4-Cl |
| A-803 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | 4-Cl |
| A-804 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | 4-Cl |
| A-805 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | 4-Cl |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---|-----------|
| A-806 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | 4-Cl |
| A-807 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | 4-Cl |
| A-808 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | 4-Cl |
| A-809 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | 4-Cl |
| A-810 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 4-Cl |
| A-811 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 4-Cl |
| A-812 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | 4-Cl |
| A-813 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | 4-Cl |
| A-814 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 4-Cl |
| A-815 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 4-Cl |
| A-816 | - | 4-F |
| A-817 | 2-Cl | 4-F |
| A-818 | 2-F | 4-F |
| A-819 | 2-Br | 4-F |
| A-820 | 2-OCH ₃ | 4-F |
| A-821 | 2-CF ₃ | 4-F |
| A-822 | 2-C ₆ H ₅ | 4-F |
| A-823 | 2-CH ₃ | 4-F |
| A-824 | 3-Cl | 4-F |
| A-825 | 3-F | 4-F |
| A-826 | 3-Br | 4-F |
| A-827 | 3-OCH ₃ | 4-F |
| A-828 | 3-CF ₃ | 4-F |
| A-829 | 3-C ₆ H ₅ | 4-F |
| A-830 | 3-CH ₃ | 4-F |
| A-831 | 4-Cl | 4-F |
| A-832 | 4-F | 4-F |
| A-833 | 4-Br | 4-F |
| A-834 | 4-OCH ₃ | 4-F |
| A-835 | 4-CF ₃ | 4-F |
| A-836 | 4-C ₆ H ₅ | 4-F |
| A-837 | 4-CH ₃ | 4-F |
| A-838 | 2-Cl, 6-Cl | 4-F |
| A-839 | 2-Cl, 5-Cl | 4-F |
| A-840 | 2-Cl, 3-Cl | 4-F |
| A-841 | 2-Cl, 4-Cl | 4-F |
| A-842 | 3-Cl, 4-Cl | 4-F |
| A-843 | 3-Cl, 5-Cl | 4-F |

| | (R ¹) _n | (R ²) _m |
|-------|---|--------------------------------|
| A-844 | 2-F, 6-F | 4-F |
| A-845 | 2-F, 5-F | 4-F |
| A-846 | 2-F, 3-F | 4-F |
| A-847 | 2-F, 4-F | 4-F |
| A-848 | 3-F, 4-F | 4-F |
| A-849 | 3-F, 5-F | 4-F |
| A-850 | 2-F, 6-Cl | 4-F |
| A-851 | 2-F, 5-Cl | 4-F |
| A-852 | 2-F, 3-Cl | 4-F |
| A-853 | 2-F, 4-Cl | 4-F |
| A-854 | 3-F, 4-Cl | 4-F |
| A-855 | 3-F, 5-Cl | 4-F |
| A-856 | 2-Cl, 6-F | 4-F |
| A-857 | 2-Cl, 5-F | 4-F |
| A-858 | 2-Cl, 3-F | 4-F |
| A-859 | 2-Cl, 4-F | 4-F |
| A-860 | 3-Cl, 4-F | 4-F |
| A-861 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | 4-F |
| A-862 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | 4-F |
| A-863 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | 4-F |
| A-864 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | 4-F |
| A-865 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | 4-F |
| A-866 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | 4-F |
| A-867 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | 4-F |
| A-868 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | 4-F |
| A-869 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 4-F |
| A-870 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 4-F |
| A-871 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | 4-F |
| A-872 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | 4-F |
| A-873 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 4-F |
| A-874 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 4-F |
| A-875 | - | 4-OCH ₃ |
| A-876 | 2-Cl | 4-OCH ₃ |
| A-877 | 2-F | 4-OCH ₃ |
| A-878 | 2-Br | 4-OCH ₃ |
| A-879 | 2-OCH ₃ | 4-OCH ₃ |
| A-880 | 2-CF ₃ | 4-OCH ₃ |
| A-881 | 2-C ₆ H ₅ | 4-OCH ₃ |

| | (R ¹) _n | (R ²) _m |
|-------|---------------------------------|--------------------------------|
| A-882 | 2-CH ₃ | 4-OCH ₃ |
| A-883 | 3-Cl | 4-OCH ₃ |
| A-884 | 3-F | 4-OCH ₃ |
| A-885 | 3-Br | 4-OCH ₃ |
| A-886 | 3-OCH ₃ | 4-OCH ₃ |
| A-887 | 3-CF ₃ | 4-OCH ₃ |
| A-888 | 3-C ₆ H ₅ | 4-OCH ₃ |
| A-889 | 3-CH ₃ | 4-OCH ₃ |
| A-890 | 4-Cl | 4-OCH ₃ |
| A-891 | 4-F | 4-OCH ₃ |
| A-892 | 4-Br | 4-OCH ₃ |
| A-893 | 4-OCH ₃ | 4-OCH ₃ |
| A-894 | 4-CF ₃ | 4-OCH ₃ |
| A-895 | 4-C ₆ H ₅ | 4-OCH ₃ |
| A-896 | 4-CH ₃ | 4-OCH ₃ |
| A-897 | 2-Cl, 6-Cl | 4-OCH ₃ |
| A-898 | 2-Cl, 5-Cl | 4-OCH ₃ |
| A-899 | 2-Cl, 3-Cl | 4-OCH ₃ |
| A-900 | 2-Cl, 4-Cl | 4-OCH ₃ |
| A-901 | 3-Cl, 4-Cl | 4-OCH ₃ |
| A-902 | 3-Cl, 5-Cl | 4-OCH ₃ |
| A-903 | 2-F, 6-F | 4-OCH ₃ |
| A-904 | 2-F, 5-F | 4-OCH ₃ |
| A-905 | 2-F, 3-F | 4-OCH ₃ |
| A-906 | 2-F, 4-F | 4-OCH ₃ |
| A-907 | 3-F, 4-F | 4-OCH ₃ |
| A-908 | 3-F, 5-F | 4-OCH ₃ |
| A-909 | 2-F, 6-Cl | 4-OCH ₃ |
| A-910 | 2-F, 5-Cl | 4-OCH ₃ |
| A-911 | 2-F, 3-Cl | 4-OCH ₃ |
| A-912 | 2-F, 4-Cl | 4-OCH ₃ |
| A-913 | 3-F, 4-Cl | 4-OCH ₃ |
| A-914 | 3-F, 5-Cl | 4-OCH ₃ |
| A-915 | 2-Cl, 6-F | 4-OCH ₃ |
| A-916 | 2-Cl, 5-F | 4-OCH ₃ |
| A-917 | 2-Cl, 3-F | 4-OCH ₃ |
| A-918 | 2-Cl, 4-F | 4-OCH ₃ |
| A-919 | 3-Cl, 4-F | 4-OCH ₃ |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---|--------------------|
| A-920 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 4-OCH ₃ |
| A-921 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 4-OCH ₃ |
| A-922 | - | 4-CH ₃ |
| A-923 | 2-Cl | 4-CH ₃ |
| A-924 | 2-F | 4-CH ₃ |
| A-925 | 2-Br | 4-CH ₃ |
| A-926 | 2-OCH ₃ | 4-CH ₃ |
| A-927 | 2-CF ₃ | 4-CH ₃ |
| A-928 | 2-C ₆ H ₅ | 4-CH ₃ |
| A-929 | 2-CH ₃ | 4-CH ₃ |
| A-930 | 3-Cl | 4-CH ₃ |
| A-931 | 3-F | 4-CH ₃ |
| A-932 | 3-Br | 4-CH ₃ |
| A-933 | 3-OCH ₃ | 4-CH ₃ |
| A-934 | 3-CF ₃ | 4-CH ₃ |
| A-935 | 3-C ₆ H ₅ | 4-CH ₃ |
| A-936 | 3-CH ₃ | 4-CH ₃ |
| A-937 | 4-Cl | 4-CH ₃ |
| A-938 | 4-F | 4-CH ₃ |
| A-939 | 4-Br | 4-CH ₃ |
| A-940 | 4-OCH ₃ | 4-CH ₃ |
| A-941 | 4-CF ₃ | 4-CH ₃ |
| A-942 | 4-C ₆ H ₅ | 4-CH ₃ |
| A-943 | 4-CH ₃ | 4-CH ₃ |
| A-944 | 2-Cl, 6-Cl | 4-CH ₃ |
| A-945 | 2-Cl, 5-Cl | 4-CH ₃ |
| A-946 | 2-Cl, 3-Cl | 4-CH ₃ |
| A-947 | 2-Cl, 4-Cl | 4-CH ₃ |
| A-948 | 3-Cl, 4-Cl | 4-CH ₃ |
| A-949 | 3-Cl, 5-Cl | 4-CH ₃ |
| A-950 | 2-F, 6-F | 4-CH ₃ |
| A-951 | 2-F, 5-F | 4-CH ₃ |
| A-952 | 2-F, 3-F | 4-CH ₃ |
| A-953 | 2-F, 4-F | 4-CH ₃ |
| A-954 | 3-F, 4-F | 4-CH ₃ |
| A-955 | 3-F, 5-F | 4-CH ₃ |
| A-956 | 2-F, 6-Cl | 4-CH ₃ |
| A-957 | 2-F, 5-Cl | 4-CH ₃ |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|-------|---|-------------------|
| A-958 | 2-F, 3-Cl | 4-CH ₃ |
| A-959 | 2-F, 4-Cl | 4-CH ₃ |
| A-960 | 3-F, 4-Cl | 4-CH ₃ |
| A-961 | 3-F, 5-Cl | 4-CH ₃ |
| A-962 | 2-Cl, 6-F | 4-CH ₃ |
| A-963 | 2-Cl, 5-F | 4-CH ₃ |
| A-964 | 2-Cl, 3-F | 4-CH ₃ |
| A-965 | 2-Cl, 4-F | 4-CH ₃ |
| A-966 | 3-Cl, 4-F | 4-CH ₃ |
| A-967 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | 4-CH ₃ |
| A-968 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | 4-CH ₃ |
| A-969 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | 4-CH ₃ |
| A-970 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | 4-CH ₃ |
| A-971 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | 4-CH ₃ |
| A-972 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | 4-CH ₃ |
| A-973 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | 4-CH ₃ |
| A-974 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | 4-CH ₃ |
| A-975 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 4-CH ₃ |
| A-976 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 4-CH ₃ |
| A-977 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | 4-CH ₃ |
| A-978 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | 4-CH ₃ |
| A-979 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 4-CH ₃ |
| A-980 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 4-CH ₃ |
| A-981 | - | 4-CF ₃ |
| A-982 | 2-Cl | 4-CF ₃ |
| A-983 | 2-F | 4-CF ₃ |
| A-984 | 2-Br | 4-CF ₃ |
| A-985 | 2-OCH ₃ | 4-CF ₃ |
| A-986 | 2-CF ₃ | 4-CF ₃ |
| A-987 | 2-C ₆ H ₅ | 4-CF ₃ |
| A-988 | 2-CH ₃ | 4-CF ₃ |
| A-989 | 3-Cl | 4-CF ₃ |
| A-990 | 3-F | 4-CF ₃ |
| A-991 | 3-Br | 4-CF ₃ |
| A-992 | 3-OCH ₃ | 4-CF ₃ |
| A-993 | 3-CF ₃ | 4-CF ₃ |
| A-994 | 3-C ₆ H ₅ | 4-CF ₃ |
| A-995 | 3-CH ₃ | 4-CF ₃ |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|--------|---------------------------------|-------------------|
| A-996 | 4-Cl | 4-CF ₃ |
| A-997 | 4-F | 4-CF ₃ |
| A-998 | 4-Br | 4-CF ₃ |
| A-999 | 4-OCH ₃ | 4-CF ₃ |
| A-1000 | 4-CF ₃ | 4-CF ₃ |
| A-1001 | 4-C ₆ H ₅ | 4-CF ₃ |
| A-1002 | 4-CH ₃ | 4-CF ₃ |
| A-1003 | 2-Cl, 6-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1004 | 2-Cl, 5-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1005 | 2-Cl, 3-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1006 | 2-Cl, 4-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1007 | 3-Cl, 4-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1008 | 3-Cl, 5-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1009 | 2-F, 6-F | 4-CF ₃ |
| A-1010 | 2-F, 5-F | 4-CF ₃ |
| A-1011 | 2-F, 3-F | 4-CF ₃ |
| A-1012 | 2-F, 4-F | 4-CF ₃ |
| A-1013 | 3-F, 4-F | 4-CF ₃ |
| A-1014 | 3-F, 5-F | 4-CF ₃ |
| A-1015 | 2-F, 6-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1016 | 2-F, 5-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1017 | 2-F, 3-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1018 | 2-F, 4-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1019 | 3-F, 4-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1020 | 3-F, 5-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1021 | 2-Cl, 6-F | 4-CF ₃ |
| A-1022 | 2-Cl, 5-F | 4-CF ₃ |
| A-1023 | 2-Cl, 3-F | 4-CF ₃ |
| A-1024 | 2-Cl, 4-F | 4-CF ₃ |
| A-1025 | 3-Cl, 4-F | 4-CF ₃ |
| A-1026 | 3-OCH ₃ , 4-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1027 | 3-OCH ₃ , 2-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1028 | 4-OCH ₃ , 3-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1029 | 4-OCH ₃ , 2-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1030 | 2-OCH ₃ , 3-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1031 | 2-OCH ₃ , 4-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1032 | 2-OCH ₃ , 5-Cl | 4-CF ₃ |
| A-1033 | 2-OCH ₃ , 6-Cl | 4-CF ₃ |

| | (R ¹) _n | (R ²) _m |
|--------|---|---|
| A-1034 | 2-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 4-CF ₃ |
| A-1035 | 2-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 4-CF ₃ |
| A-1036 | 2-OCH ₃ , 3-OCH ₃ | 4-CF ₃ |
| A-1037 | 2-OCH ₃ , 6-OCH ₃ | 4-CF ₃ |
| A-1038 | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | 4-CF ₃ |
| A-1039 | 3-OCH ₃ , 4-OCH ₃ | 4-CF ₃ |
| A-1040 | - | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1041 | 2-Cl | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1042 | 2-F | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1043 | 2-Br | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1044 | 2-OCH ₃ | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1045 | 2-CF ₃ | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1046 | 2-C ₆ H ₅ | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1047 | 2-CH ₃ | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1048 | 3-Cl | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1049 | 3-F | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1050 | 3-Br | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1051 | 3-OCH ₃ | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1052 | 3-CF ₃ | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1053 | 3-C ₆ H ₅ | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1054 | 3-CH ₃ | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1055 | 4-Cl | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1056 | 4-F | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1057 | 4-Br | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1058 | 4-OCH ₃ | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1059 | 4-CF ₃ | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1060 | 4-C ₆ H ₅ | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1061 | 4-CH ₃ | 3-Cl, 4-Cl |
| A-1062 | - | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1063 | 2-Cl | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1064 | 2-F | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1065 | 2-Br | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1066 | 2-OCH ₃ | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1067 | 2-CF ₃ | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1068 | 2-C ₆ H ₅ | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1069 | 2-CH ₃ | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1070 | 3-Cl | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1071 | 3-F | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|--------|---------------------------------|---|
| A-1072 | 3-Br | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1073 | 3-OCH ₃ | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1074 | 3-CF ₃ | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1075 | 3-C ₆ H ₅ | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1076 | 3-CH ₃ | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1077 | 4-Cl | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1078 | 4-F | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1079 | 4-Br | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1080 | 4-OCH ₃ | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1081 | 4-CF ₃ | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1082 | 4-C ₆ H ₅ | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1083 | 4-CH ₃ | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ |
| A-1084 | - | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1085 | 2-Cl | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1086 | 2-F | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1087 | 2-Br | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1088 | 2-OCH ₃ | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1089 | 2-CF ₃ | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1090 | 2-C ₆ H ₅ | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1091 | 2-CH ₃ | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1092 | 3-Cl | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1093 | 3-F | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1094 | 3-Br | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1095 | 3-OCH ₃ | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1096 | 3-CF ₃ | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1097 | 3-C ₆ H ₅ | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1098 | 3-CH ₃ | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1099 | 4-Cl | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1100 | 4-F | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1101 | 4-Br | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1102 | 4-OCH ₃ | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1103 | 4-CF ₃ | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1104 | 4-C ₆ H ₅ | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1105 | 4-CH ₃ | 3-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1106 | - | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1107 | 2-Cl | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1108 | 2-F | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1109 | 2-Br | 3-OCH ₃ , 2-Cl |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|--------|---------------------------------|---------------------------|
| A-1110 | 2-OCH ₃ | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1111 | 2-CF ₃ | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1112 | 2-C ₆ H ₅ | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1113 | 2-CH ₃ | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1114 | 3-Cl | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1115 | 3-F | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1116 | 3-Br | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1117 | 3-OCH ₃ | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1118 | 3-CF ₃ | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1119 | 3-C ₆ H ₅ | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1120 | 3-CH ₃ | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1121 | 4-Cl | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1122 | 4-F | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1123 | 4-Br | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1124 | 4-OCH ₃ | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1125 | 4-CF ₃ | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1126 | 4-C ₆ H ₅ | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1127 | 4-CH ₃ | 3-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1128 | - | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1129 | 2-Cl | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1130 | 2-F | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1131 | 2-Br | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1132 | 2-OCH ₃ | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1133 | 2-CF ₃ | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1134 | 2-C ₆ H ₅ | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1135 | 2-CH ₃ | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1136 | 3-Cl | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1137 | 3-F | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1138 | 3-Br | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1139 | 3-OCH ₃ | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1140 | 3-CF ₃ | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1141 | 3-C ₆ H ₅ | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1142 | 3-CH ₃ | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1143 | 4-Cl | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1144 | 4-F | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1145 | 4-Br | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1146 | 4-OCH ₃ | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1147 | 4-CF ₃ | 4-OCH ₃ , 3-Cl |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|--------|---------------------------------|---------------------------|
| A-1148 | 4-C ₆ H ₅ | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1149 | 4-CH ₃ | 4-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1150 | - | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1151 | 2-Cl | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1152 | 2-F | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1153 | 2-Br | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1154 | 2-OCH ₃ | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1155 | 2-CF ₃ | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1156 | 2-C ₆ H ₅ | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1157 | 2-CH ₃ | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1158 | 3-Cl | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1159 | 3-F | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1160 | 3-Br | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1161 | 3-OCH ₃ | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1162 | 3-CF ₃ | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1163 | 3-C ₆ H ₅ | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1164 | 3-CH ₃ | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1165 | 4-Cl | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1166 | 4-F | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1167 | 4-Br | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1168 | 4-OCH ₃ | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1169 | 4-CF ₃ | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1170 | 4-C ₆ H ₅ | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1171 | 4-CH ₃ | 4-OCH ₃ , 2-Cl |
| A-1172 | - | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1173 | 2-Cl | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1174 | 2-F | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1175 | 2-Br | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1176 | 2-OCH ₃ | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1177 | 2-CF ₃ | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1178 | 2-C ₆ H ₅ | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1179 | 2-CH ₃ | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1180 | 3-Cl | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1181 | 3-F | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1182 | 3-Br | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1183 | 3-OCH ₃ | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1184 | 3-CF ₃ | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1185 | 3-C ₆ H ₅ | 2-OCH ₃ , 3-Cl |

| | (R ¹) _n | (R ²) _m |
|--------|---------------------------------|--------------------------------|
| A-1186 | 3-CH ₃ | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1187 | 4-Cl | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1188 | 4-F | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1189 | 4-Br | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1190 | 4-OCH ₃ | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1191 | 4-CF ₃ | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1192 | 4-C ₆ H ₅ | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1193 | 4-CH ₃ | 2-OCH ₃ , 3-Cl |
| A-1194 | - | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1195 | 2-Cl | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1196 | 2-F | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1197 | 2-Br | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1198 | 2-OCH ₃ | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1199 | 2-CF ₃ | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1200 | 2-C ₆ H ₅ | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1201 | 2-CH ₃ | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1202 | 3-Cl | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1203 | 3-F | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1204 | 3-Br | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1205 | 3-OCH ₃ | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1206 | 3-CF ₃ | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1207 | 3-C ₆ H ₅ | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1208 | 3-CH ₃ | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1209 | 4-Cl | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1210 | 4-F | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1211 | 4-Br | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1212 | 4-OCH ₃ | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1213 | 4-CF ₃ | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1214 | 4-C ₆ H ₅ | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1215 | 4-CH ₃ | 2-OCH ₃ , 4-Cl |
| A-1216 | - | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1217 | 2-Cl | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1218 | 2-F | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1219 | 2-Br | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1220 | 2-OCH ₃ | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1221 | 2-CF ₃ | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1222 | 2-C ₆ H ₅ | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1223 | 2-CH ₃ | 2-OCH ₃ , 5-Cl |

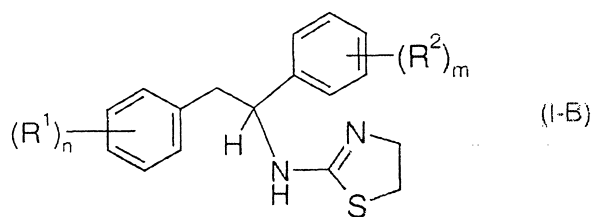
| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|--------|---------------------------------|---------------------------|
| A-1224 | 3-Cl | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1225 | 3-F | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1226 | 3-Br | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1227 | 3-OCH ₃ | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1228 | 3-CF ₃ | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1229 | 3-C ₆ H ₅ | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1230 | 3-CH ₃ | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1231 | 4-Cl | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1232 | 4-F | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1233 | 4-Br | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1234 | 4-OCH ₃ | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1235 | 4-CF ₃ | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1236 | 4-C ₆ H ₅ | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1237 | 4-CH ₃ | 2-OCH ₃ , 5-Cl |
| A-1238 | - | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1239 | 2-Cl | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1240 | 2-F | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1241 | 2-Br | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1242 | 2-OCH ₃ | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1243 | 2-CF ₃ | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1244 | 2-C ₆ H ₅ | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1245 | 2-CH ₃ | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1246 | 3-Cl | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1247 | 3-F | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1248 | 3-Br | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1249 | 3-OCH ₃ | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1250 | 3-CF ₃ | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1251 | 3-C ₆ H ₅ | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1252 | 3-CH ₃ | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1253 | 4-Cl | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1254 | 4-F | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1255 | 4-Br | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1256 | 4-OCH ₃ | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1257 | 4-CF ₃ | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1258 | 4-C ₆ H ₅ | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1259 | 4-CH ₃ | 2-OCH ₃ , 6-Cl |
| A-1260 | - | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1261 | 2-Cl | 2-Cl, 5-Cl |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|--------|---------------------------------|------------|
| A-1262 | 2-F | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1263 | 2-Br | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1264 | 2-OCH ₃ | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1265 | 2-CF ₃ | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1266 | 2-C ₆ H ₅ | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1267 | 2-CH ₃ | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1268 | 3-Cl | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1269 | 3-F | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1270 | 3-Br | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1271 | 3-OCH ₃ | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1272 | 3-CF ₃ | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1273 | 3-C ₆ H ₅ | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1274 | 3-CH ₃ | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1275 | 4-Cl | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1276 | 4-F | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1277 | 4-Br | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1278 | 4-OCH ₃ | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1279 | 4-CF ₃ | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1280 | 4-C ₆ H ₅ | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1281 | 4-CH ₃ | 2-Cl, 5-Cl |
| A-1282 | | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1283 | 2-Cl | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1284 | 2-F | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1285 | 2-Br | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1286 | 2-OCH ₃ | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1287 | 2-CF ₃ | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1288 | 2-C ₆ H ₅ | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1289 | 2-CH ₃ | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1290 | 3-Cl | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1291 | 3-F | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1292 | 3-Br | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1293 | 3-OCH ₃ | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1294 | 3-CF ₃ | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1295 | 3-C ₆ H ₅ | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1296 | 3-CH ₃ | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1297 | 4-Cl | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1298 | 4-F | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1299 | 4-Br | 2-Cl, 4-Cl |

| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|--------|---------------------------------|------------|
| A-1300 | 4-OCH ₃ | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1301 | 4-CF ₃ | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1302 | 4-C ₆ H ₅ | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1303 | 4-CH ₃ | 2-Cl, 4-Cl |
| A-1304 | - | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1305 | 2-Cl | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1306 | 2-F | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1307 | 2-Br | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1308 | 2-OCH ₃ | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1309 | 2-CF ₃ | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1310 | 2-C ₆ H ₅ | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1311 | 2-CH ₃ | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1312 | 3-Cl | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1313 | 3-F | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1314 | 3-Br | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1315 | 3-OCH ₃ | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1316 | 3-CF ₃ | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1317 | 3-C ₆ H ₅ | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1318 | 3-CH ₃ | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1319 | 4-Cl | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1320 | 4-F | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1321 | 4-Br | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1322 | 4-OCH ₃ | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1323 | 4-CF ₃ | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1324 | 4-C ₆ H ₅ | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1325 | 4-CH ₃ | 2-Cl, 3-Cl |
| A-1326 | - | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1327 | 2-Cl | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1328 | 2-F | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1329 | 2-Br | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1330 | 2-OCH ₃ | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1331 | 2-CF ₃ | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1332 | 2-C ₆ H ₅ | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1333 | 2-CH ₃ | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1334 | 3-Cl | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1335 | 3-F | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1336 | 3-Br | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1337 | 3-OCH ₃ | 2-Cl, 6-Cl |

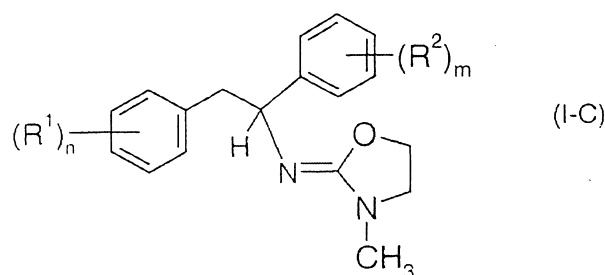
| | $(R^1)_n$ | $(R^2)_m$ |
|--------|---------------------------------|------------|
| A-1338 | 3-CF ₃ | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1339 | 3-C ₆ H ₅ | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1340 | 3-CH ₃ | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1341 | 4-Cl | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1342 | 4-F | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1343 | 4-Br | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1344 | 4-OCH ₃ | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1345 | 4-CF ₃ | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1346 | 4-C ₆ H ₅ | 2-Cl, 6-Cl |
| A-1347 | 4-CH ₃ | 2-Cl, 6-Cl |

在式I化合物中，較佳為下列式I-B之化合物，其中式I中A為A²基，X為S，且其中n，m，R¹及R²具有上述意義。



這些化合物之實例為 $(R^1)_n$ 及 $(R^2)_m$ 具有表A各列中所示之意義者(化合物I-B.1至I-B.1347)。

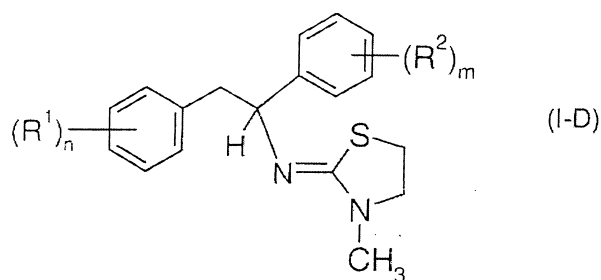
在式I化合物中，較佳為下列式I-C之化合物，其中式I中A為A¹基，X為O，R⁶為CH₃，且其中n，m，R¹及R²具有上述意義。



這些化合物之實例為 $(R^1)_n$ 及 $(R^2)_m$ 具有表A各列中所示之意義者(化合物I-C.1至I-C.1347)。

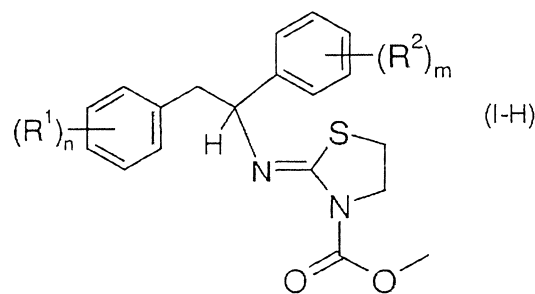
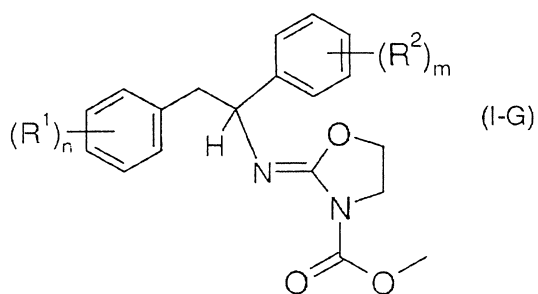
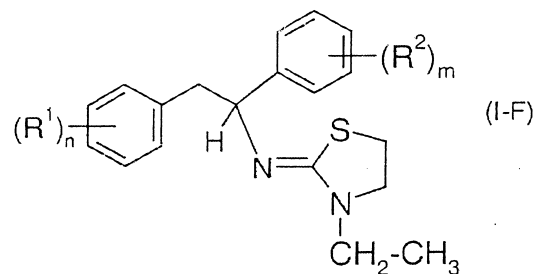
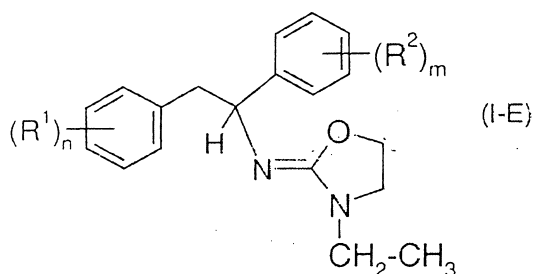
在式I化合物中，較佳為下列式I-D之化合物，其中式I中

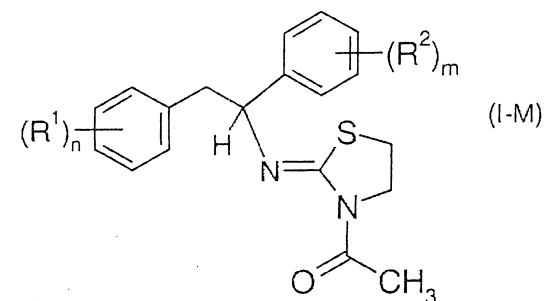
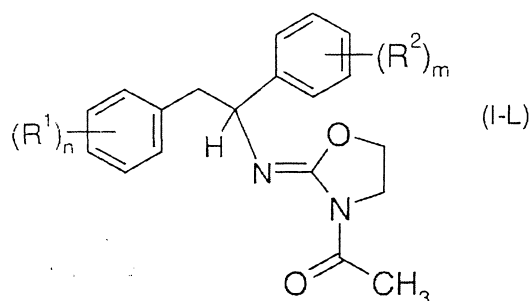
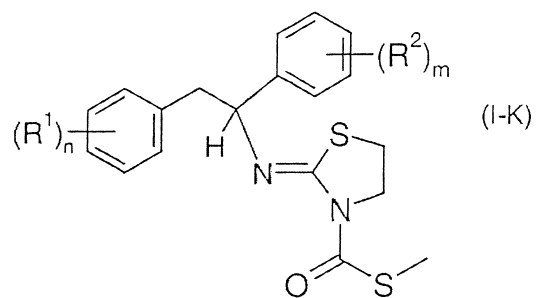
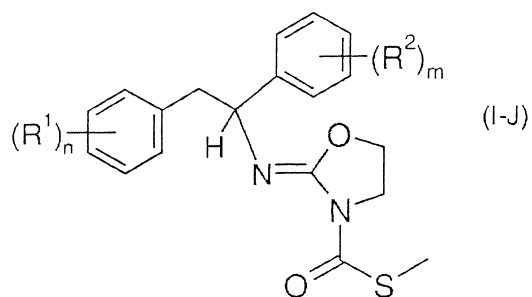
A 為 A^1 基，X 為 S， R^6 為 CH_3 ，且其中 n ， m ， R^1 及 R^2 具有上述意義。



這些化合物之實例為 $(R^1)_n$ 及 $(R^2)_m$ 具有表 A 各列中所示之意義者(化合物 I-D.1 至 I-D.1347)。

在式 I 化合物中，較佳為下列式 I-E，I-F，I-G，I-H，I-J，I-K，I-L 及 I-M 之化合物，其中 n ， m ， R^1 及 R^2 具有上述意義。

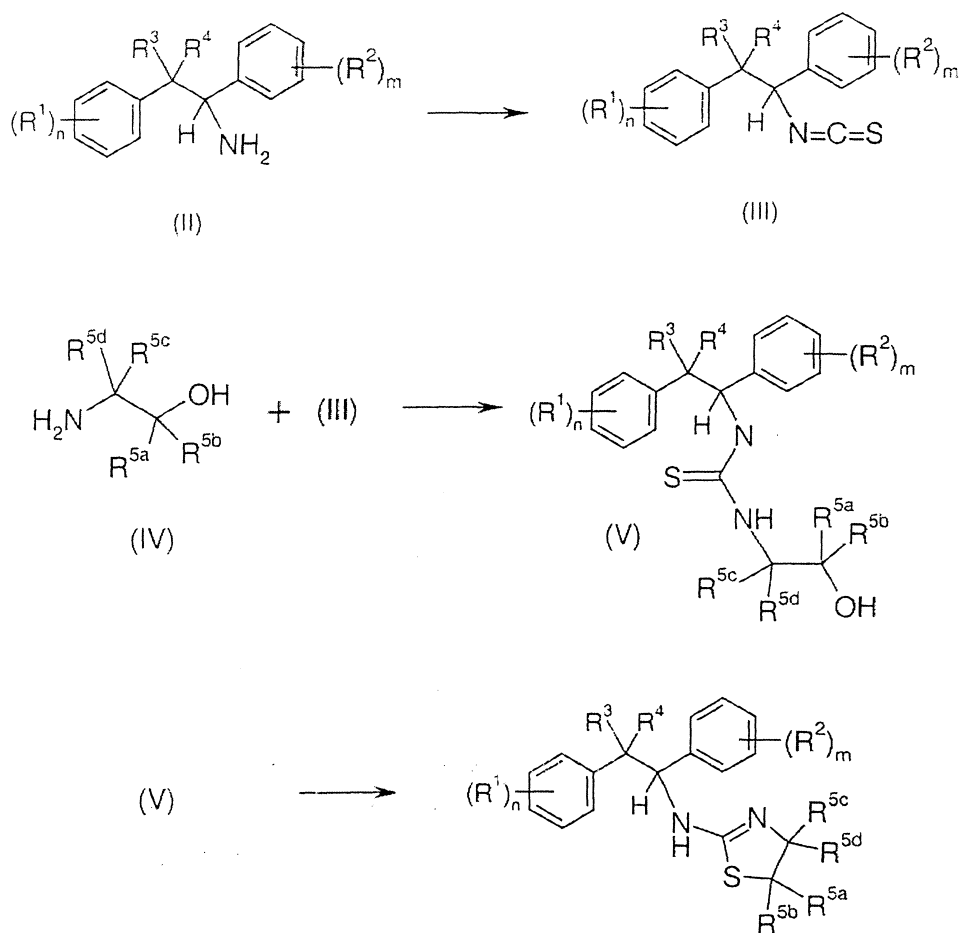




這些化合物之實例為 $(R^1)_n$ 及 $(R^2)_m$ 具有表 A 各列中所示之意義者 (化合物 I-E.1 至 I-E.1347, I-F.1 至 I-F.1347, I-G.1 至 I-G.1347, I-H.1 至 I-H.1347, I-J.1 至 I-J.1347, I-K.1 至 I-K.1347, I-L.1 至 I-L.1347, I-M.1 至 I-M.1347)。

本發明之化合物可由例如對應之二苯基乙胺 II 以概圖 1 及 2 中所示之合成途徑製備。式 I 中 A 為 A^2 , X 為 S, 及 R^7 為 H 之化合物可根據概圖 1 中所示之方法獲得：

概圖 1：

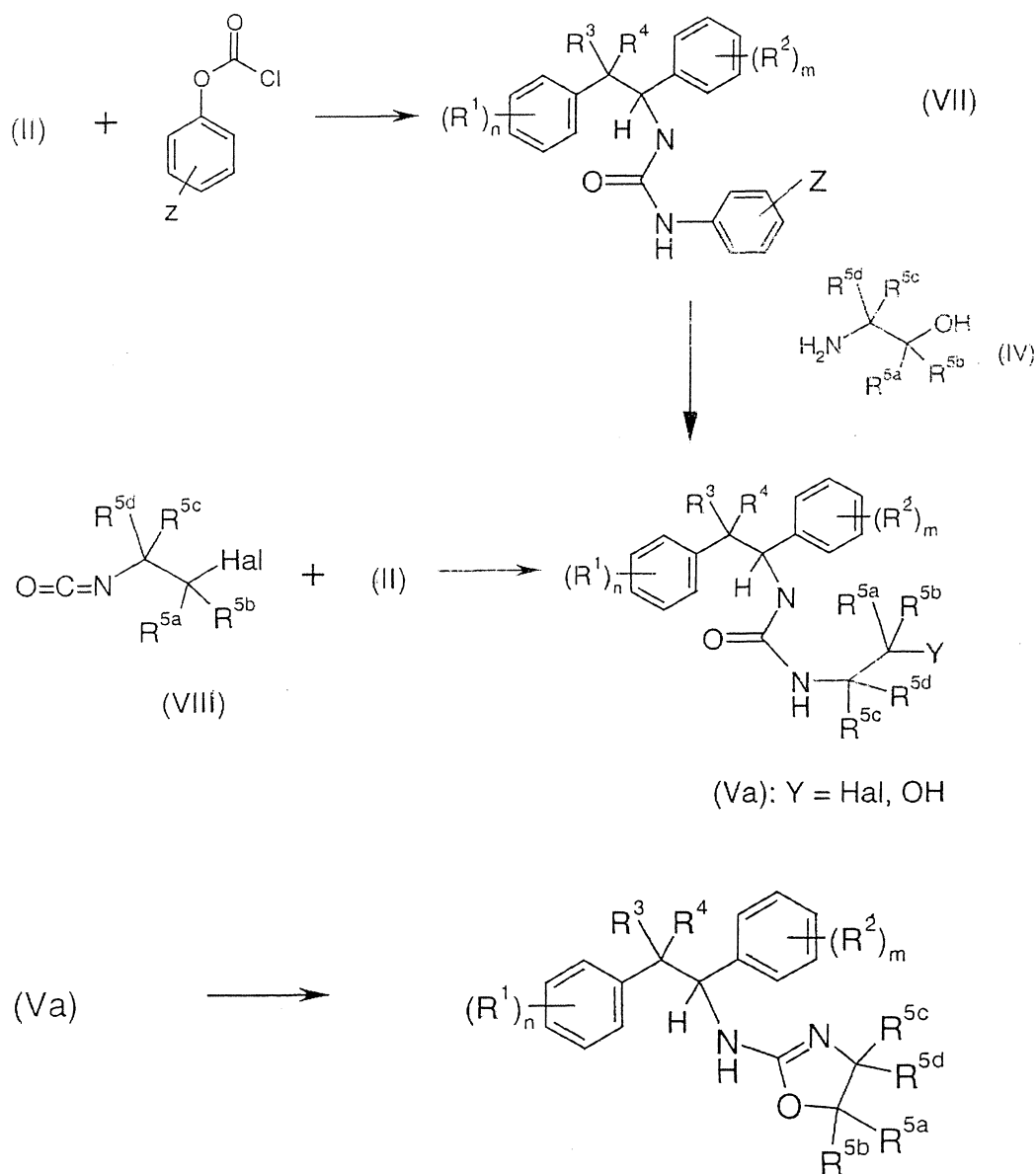


根據概圖 1 中所示之方法，1,2-二苯基胺基乙烷 II 以習知方式轉化為對應之異硫氰酸酯 III，例如由 II 與硫光氣反應（參見例如 Houben-Weyl, E4, "Methoden der Organischen Chemie", chapter IIIc, pp.837-842）。然後異硫氰酸酯 III 與一種通式 IV 之胺基乙醇反應，獲得式 V 之硫脲化合物。胺基乙醇 IV 與異硫氰酸酯 III 之反應可根據有機化學之標準方法進行，參見例如 Biosci. Biotech. Biochem. 1992, 56 (7), 1062-1065。

所獲得之硫脲可以習知方式環化，獲得所欲之式 I 之噻唑啉化合物，其中 A 為 A²，X 為 S，R⁷ 為 H。化合物 V 之環化可例如在酸催化下或在脫水條件下例如以 Mitsunobu 反應達成（參見 Tetrahedron Letters 1999, 40, 3125-3128）。

式 I 中 A 為 A^2 ，X 為 O， R^7 為 H 之化合物可以相似於概圖 1 中所示方法之途徑獲得 (亦參見 *Pestic. Biochem. Physiol.* 1988, 30, 190-197)。不像概圖 1 之方法，二苯基胺基乙烷 II 例如與光氣，二光氣，或另一種光氣相等物反應而轉化為對應之異氰酸酯 IIIa。然後異氰酸酯 IIIa 與胺基乙醇 IV 反應，所獲得之脲環化。

式 I 中 A 為 A^2 ，X 為 O， R^7 為 H 之化合物亦可由概圖 2 中所示之方法獲得。在概圖 2 中，變數 Hal 為鹵素，特別是氯，Y 為 OH 或鹵素，Z 為氫，烷基，或鹵素，特別是氟。



根據概圖 2，二苯基胺基乙烷 II 與一種氯甲酸苯酯 (如氯甲酸 4-氯苯酯) 根據標準方法反應而轉化為對應之式 VII 之胺基甲酸酯 (參見例如 Pesticide Biochemistry and physiology 30, 1988, p.190-197)。所獲得之胺基甲酸酯 VII 與胺基醇 IV 在三甲基氯矽烷存在下根據 J. Org. Chem. 1998, 63, 8515-8521 中所述之方法反應。獲得式 Va 之 2-羥基乙基脲 (Y=OH)。2-羥基乙基脲可根據 Org. Lett. 1999, 1, 1705-1708 或 Tetrahedron Lett. 1992, 33, 2807-2810 中所述之程序環化

成嘮啞啞化合物I。

或者，經取代之2-氯乙基脲Va(X=Cl)可根據Bioorg. Med. Chem. Lett. 1994, 4, 2317-2322中所述之方法或在下述條件下環化。氯乙基脲Va可由對應之二苯基乙胺II與2-氯乙基異氰酸酯VIII反應而獲得。

式I中A為A¹基，其中R⁶不為氫，或A²基，其中R⁷不為氫之化合物可由式I具有R⁶(或R⁷，分別)之化合物作為起始物質而獲得。

為獲得式I中R⁶或R⁷為C₁-C₆-烷基或烷基-C₁-C₆-烷基羰基之化合物，起始物質與一種適合之烷基化或醃化劑R^a-L反應，其中L為一個離去基，例如鹵素，R^a為C₁-C₆-烷基或烷基-C₁-C₆-烷基羰基。反應可以有機合成之標準教科書中所述之例行方法進行，參見例如J. March, Advanced Organic Synthesis, 3rd ed. John Wiley and Sons。

為獲得式I中R⁶或R⁷為C₁-C₆-烷氧基羰基或C₁-C₆-烷硫基羰基之化合物，起始物質與一種適合之式R^b-C(O)-Hal之鹵甲酸酯反應，其中Hal為鹵素，特別是氯，R^b為C₁-C₆-烷氧基或C₁-C₆-烷硫基。反應可以有機合成之標準教科書中所述之例行方法進行，參見例如J. March, Advanced Organic Synthesis, 3rd ed. John Wiley and Sons。

氰基可加入作為R⁶或R⁷基，例如由起始物質與溴化氰根據本案實驗部份所述之方法反應。硝基加入作為R⁶或R⁷基可由R⁶或R⁷為H之化合物與鎔基(nitronium)來源根據此技藝中眾所周知之標準方法反應而進行。

(SO₂)NR^aR^b基可加入作為R⁶或R⁷基，例如由起始物質與氯磺醯胺Cl-(SO₂)NR^aR^b根據有機合成之標準教科書中所述之例行方法反應，參見例如J. March, *Advanced Organic Synthesis*, 3rd ed. John Wiley and Sons。

C(O)NR^aR^b基可加入作為R⁶或R⁷基，例如由起始物質與氯甲醯胺Cl-CO-NR^aR^b反應或與異氰酸酯OCN-R^a(R^b為氫)反應。

式II之二苯基乙胺在此技藝中已知(例如1,2-二苯基乙胺，CAS-Nr.[3082-58-4])，或可以有機化學家熟悉及此技藝中眾所周知之方法製備。製備二苯基乙胺II之適合方法本質上包含對應之苯基苯甲基酮還原胺化或對應之苯基苯甲基肱還原(參見例如J. Med. Chem. 1995, 38, 1600-1607; J. Med. Chem. 1994, 37(7), 913-923)。式II之二苯基乙胺亦可由苯基-或苯甲基-有機金屬試劑加入一種適合亞胺如一種苯甲醛-或2-苯基乙醛化合物之第三丁基亞磺醯基亞胺中根據Tetrahedron, 1999, 55, S.8883-8904中所述之方法製備。

2-胺基乙醇化合物IV及2-胺基乙基異氰酸酯VIII為商業上可得，或可根據有機化學家熟悉之例行方法製備。

由於極佳活性，通式I之化合物可用於控制動物害蟲，選自有害昆蟲，蜘蛛，及線蟲。因此，本發明另提供對抗該動物害蟲之農業組合物，其包含一量之至少一種通式I之化合物或至少一種I之農業上有用鹽，及至少一種惰性液體及/或固體農藝上可接受之載劑，其具有除害作用，及若需要，至少一種表面活性劑。

該組合物可含有本發明之單一通式I之活性化合物或幾種活性化合物I之混合物。根據本發明之組合物可包含各異構物或異構物之混合物及各互變體或互變體之混合物。

式I之化合物及包含彼等之除害組合物為控制動物害蟲選自昆蟲，蜘蛛，及線蟲之有效劑。式I化合物所控制之動物害蟲包括例如：

鱗翅目昆蟲 (*Lepidoptera*)，例如小地老虎 (*Agrotis ypsilon*)，黃地老虎 (*Agrotis segetum*)，棉葉波紋葉蛾 (*Alabama argillacea*)，黎豆夜蛾 (*Anticarsia gemmatalis*)，蘋實巢蛾 (*Argyresthia conjugella*)，Y紋夜蛾 (*Autographa gamma*)，松尺蠖 (*Bupalus piniarius*)，*Cacoecia murinana*，*Capua reticulana*，*Cheimatobia brumata*，雲杉捲葉蛾 (*Choristoneura fumiferana*)，西方雲杉捲葉蛾 (*Choristoneura occidentalis*)，美洲黏蟲 (*Cirphis unipuncta*)，蘋果蠹蛾 (*Cydia pomonella*)，歐洲松毛蟲 (*Dendrolimus pini*)，瓜野螟 (*Diaphania nitidalis*)，巨座玉米螟 (*Diatraea grandiosella*)，埃及金剛鑽 (*Earias insulana*)，小玉米螟 (*Elasmopalpus lignosellus*)，*Eupoecilia ambiguella*，*Evetria bouliana*，粒膚地老虎 (*Feltia subterranea*)，大蠟螟 (*Galleria mellonella*)，李小食心蟲 (*Grapholitha funebrana*)，梨小食心蟲 (*Grapholitha molesta*)，棉鈴蟲 (*Heliothis armigera*)，美洲菸葉蛾 (*Heliothis virescens*)，美洲棉鈴蟲 (*Heliothis zea*)，菜螟 (*Hellula undalis*)，*Hibernia defoliaria*，美國白蛾 (*Hyphantria cunea*)，蘋果巢蛾 (*Hyponomeuta*

malinellus), 蕃茄蠹蛾 (*Keiferia lycopersicella*), 鐵杉尺蠖 (*Lambdina fiscellaria*), 甜菜夜蛾 (*Laphygma exigua*), 咖啡點潛蛾 (*Leucoptera coffeella*), 旋紋潛葉蛾 (*Leucoptera scitella*), *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, 黃綠條螟 (*Loxostege sticticalis*), 舞毒蛾 (*Lymantria dispar*), 僧尼毒蛾 (*Lymantria monacha*), 窄翅潛葉蛾 (*Lyonetia clerkella*), 天幕毛蟲 (*Malacosoma neustria*), 甘藍夜蛾 (*Mamestra brassicae*), *Orgyia pseudotsugata*, 歐洲玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*), *Panolis flammea*, 紅鈴蟲 (*Pectinophora gossypiella*), 豆雜角夜蛾 (*Peridroma saucia*), *Phalera bucephala*, 馬鈴薯塊莖蛾 (*Phthorimaea operculella*), 橘細潛蛾 (*Phyllocnistis citrella*), 大菜粉蛾 (*Pieris brassicae*), 苜蓿綠夜蛾 (*Plathypena scabra*), 小菜蛾 (*Plutella xylostella*), 大豆夜蛾 (*Pseudoplusia includens*), 松梢捲葉蛾 (*Rhyacionia frustrana*), *Scrobipalpula absoluta*, 麥蛾 (*Sitotroga cerealella*), 葡萄長鬚捲葉蛾 (*Sparganothis pilleriana*), 草地黏蟲 (*Spodoptera frugiperda*), *Spodoptera littoralis*, 斜紋夜蛾 (*Spodoptera litura*), *Thaumatopoea pityocampa*, 櫟綠捲葉蛾 (*Tortrix viridana*), 粉紋夜蛾 (*Trichoplusia ni*), 及雲杉小捲葉蛾 (*Zeiraphera canadensis*);

甲蟲 (鞘翅目 (*Coleoptera*)), 例如梨長吉丁 (*Agrilus sinuatus*), 具條叩甲 (*Agriotes lineatus*), *Agriotes obscurus*, 六月金龜 (*Amphimallus solstitialis*), *Anisandrus dispar*, 棉鈴象甲 (*Anthonomus grandis*), 蘋果花象甲 (*Anthonomus*

pomorum), *Atomaria linearis*, 大松小蠹 (*Blastophagus pini-perda*), *Blitophaga undata*, 蠶豆象 (*Bruchus rufimanus*), *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, 蘋果捲葉象甲 (*Byctiscus betulae*), *Cassida nebulosa*, 豆葉甲 (*Cerotoma trifurcata*), 甘藍莢象甲 (*Ceuthorrhynchus assimilis*), *Ceuthorrhynchus napi*, 甜菜脛跳甲 (*Chaetocnema tibialis*), 煙草金針蟲 (*Conoderus vespertinus*), 天門冬葉甲 (*Crioceris asparagi*), 長角葉甲 (*Diabrotica longicornis*), 十二星瓜葉甲 (*Diabrotica 12-punctata*), 玉米根葉甲 (*Diabrotica virgifera*), 墨西哥豆瓢蟲 (*Epilachna varivestis*), 煙草跳甲 (*Epitrix hirtipennis*), *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, 埃及苜蓿象甲 (*Hypera brunneipennis*), 苜蓿葉象甲 (*Hypera postica*), *Ips typographus*, 具條負泥蟲 (*Lema bilineata*), *Lema melanopus*, 馬鈴薯甲蟲 (*Leptinotarsa decemlineata*), 甜菜金針蟲 (*Limonius californicus*), 稻象甲 (*Lissorhoptrus oryzophilus*), *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, 忽布鰓角金龜 (*Melolontha hippocastani*), *Melolontha melolontha*, 稻負泥蟲 (*Oulema oryzae*), *Ortiorrhynchus sulcatus*, 草莓根象甲 (*Otiorrhynchus ovatus*), *Phaedon cochleariae*, *Phyllotreta chrysocephala*, 金龜屬 (*Phyllophaga* sp.), 庭園麗金龜 (*Phyllopertha horticola*), 蕪菁淡足跳甲 (*Phyllotreta nemorum*), 黃曲條跳甲 (*Phyllotreta striolata*), 日本麗金龜 (*Popillia japonica*), 豌豆葉象甲 (*Sitona lineatus*), 及谷象 (*Sitophilus granaria*)。

雙翅目昆蟲 (*Diptera*)，例如埃及伊蚊 (*Aedes aegypti*)，*Aedes vexans*，墨西哥橘實蠅 (*Anastrepha ludens*)，五斑按蚊 (*Anopheles maculipennis*)，地中海實蠅 (*Ceratitis capitata*)，*Chrysomya bezziana*，*Chrysomya hominivorax*，*Chrysomya macellaria*，高粱癭蚊 (*Contarinia sorghicola*)，*Cordylobia anthropophaga*，五帶淡色庫蚊 (*Culex pipiens*)，瓜實蠅 (*Dacus cucurbitae*)，油橄欖實蠅 (*Dacus oleae*)，莖苔莢癭蚊 (*Dasineura brassicae*)，黃腹廢蠅 (*Fannia canicularis*)，大馬胃蠅 (*Gasterophilus intestinalis*)，*Glossina morsitans*，騷擾角蠅 (*Haematobia irritans*)，*Haplodiplosis equestris*，種蠅 (*Hylemyia platura*)，蚊皮蠅 (*Hypoderma lineata*)，*Liriomyza sativae*，*Liriomyza trifolii*，*Lucilia caprina*，*Lucilia cuprina*，絲光綠蠅 (*Lucilia sericata*)，*Lycoria pectoralis*，*Mayetiola destructor*，家蠅 (*Musca domestica*)，廢腐蠅 (*Muscina stabulans*)，羊鼻蠅 (*Oestrus ovis*)，瑞典麥杆蠅 (*Oscinella frit*)，甜菜潛葉蠅 (*Pegomya hysocyami*)，*Phorbia antiqua*，*Phorbia brassicae*，*Phorbia coarctata*，櫻桃實蠅 (*Rhagoletis cerasi*)，蘋果實蠅 (*Rhagoletis pomonella*)，牛虻 (*Tabanus bovinus*)，*Tipula oleracea*，及歐洲大蚊 (*Tipula paludosa*)；

薊馬 (繆翅目 (*Thysanoptera*))，例如 *Dichromothrips corbetti*，煙草褐薊馬 (*Frankliniella fusca*)，苜蓿薊馬 (*Frankliniella occidentalis*)，花薊馬 (*Frankliniella tritici*)，橘實薊馬 (*Scirtothrips citri*)，稻薊馬 (*Thrips oryzae*)，*Thrips*

palmi，及 *Thrips tabaci*;

膜翅目昆蟲 (*Hymenoptera*)，例如新疆菜葉蜂 (*Athalia rosae*)，*Atta cephalotes*，*Atta sexdens*，德州切葉蟻 (*Atta texana*)，*Hoplocampa minuta*，蘋實葉蜂 (*Hoplocampa testudinea*)，廚蟻 (*Monomorium pharaonis*)，火蟻 (*Solenopsis geminata*)，及外引紅火蟻 (*Solenopsis invicta*);

異翅目昆蟲 (*Heteroptera*)，例如喜綠蝽 (*Acrosternum hilare*)，多毛長蝽 (*Blissus leucopterus*)，煙草黑斑盲蝽 (*Cyrtopeltis notatus*)，棉紅蝽 (*Dysdercus cingulatus*)，*Dysdercus intermedius*，*Eurygaster integriceps*，棉褐蝽 (*Euschistus impictiventris*)，葉足緣蝽 (*Leptoglossus phyllopus*)，牧草盲蝽 (*Lygus lineolaris*)，牧草盲蝽 (*Lygus pratensis*)，稻綠蝽 (*Nezara viridula*)，甜菜檢網蝽 (*Piesma quadrata*)，*Solubea insularis*，及 *Thyanta perditor*;

同翅目昆蟲 (*Homoptera*)，例如 *Acyrtosiphon onobrychis*，落葉松球蚜 (*Adelges laricis*)，*Aphidula nasturtii*，蠶豆蚜 (*Aphis fabae*)，草莓根蚜 (*Aphis forbesi*)，蘋果蚜 (*Aphis pomi*)，棉蚜 (*Aphis gossypii*)，醋栗蚜 (*Aphis grossulariae*)，*Aphis schneideri*，繡線菊蚜 (*Aphis spiraecola*)，*Aphis sambuci*，豌豆蚜 (*Acyrtosiphon pisum*)，馬鈴薯長鬚蚜 (*Aulacorthum solani*)，*Bemisia argentifolii*，薊短尾蚜 (*Brachycaudus cardui*)，李短尾蚜 (*Brachycaudus helichrysi*)，桃黑短尾蚜 (*Brachycaudus persicae*)，*Brachycaudus prunicola*，甘藍蚜 (*Brevicoryne brassicae*)，

角釘毛蚜 (*Capitophorus horni*) , *Cerosipha gossypii* , 草莓毛管蚜 (*Chaetosiphon fragaefolii*) , 茶蔗隱瘤額蚜 (*Cryptomyzus ribis*) , *Dreyfusia nordmannianae* , *Dreyfusia piceae* , *Dysaphis radicola* , *Dysaulacorthum pseudosolani* , 蘋粉紅劣蚜 (*Dysaphis plantaginea*) , *Dysaphis pyri* , 蠶豆微葉蟬 (*Empoasca fabae*) , 梅大尾蚜 (*Hyalopterus pruni*) , 茶蔗苦菜蚜 (*Hyperomyzus lactucae*) , 麥長管蚜 (*Macrosiphum avenae*) , 大戟長管蚜 (*Macrosiphum euphorbiae*) , 薔薇長管蚜 (*Macrosiphon rosae*) , 蠶豆修尾蚜 (*Megoura viciae*) , *Melanaphis pyrarius* , 薔薇麥蚜 (*Metopolophium dirhodum*) , *Myzodes persicae* , 冬蔥瘤額蚜 (*Myzus ascalonicus*) , 櫻桃黑瘤額蚜 (*Myzus cerasi*) , 桃蚜 (*Myzus persicae*) , 核黃瘤額蚜 (*Myzus vari-ans*) , 萵苣蚜 (*Nasonovia ribis-nigri*) , 褐稻虱 (*Nilaparvata lugens*) , 萵苣根癭綿蚜 (*Pemphigus bursarius*) , 蔗飛虱 (*Perkinsiella saccharicida*) , *Phorodon humuli* , 蘋木虱 (*Psylla mali*) , 梨木虱 (*Psylla piri*) , *Rhopalomyzus ascalonicus* , 玉米縊管蚜 (*Rhopalosiphum maidis*) , 粟縊管蚜 (*Rhopalosiphum padi*) , *Rhopalosiphum insertum* , *Sappaphis mala* , *Sappaphis mali* , 麥二叉蚜 (*Schizaphis graminum*) , *Schizoneura lanuginosa* , *Sitobion avenae* , 白背飛虱 (*Sogatella furcifera*) , 溫室白粉虱 (*Trialeurodes vaporariorum*) , 橘二岔蚜 (*Toxoptera aurantii*) , 及葡萄根瘤蚜 (*Viteus vitifolii*) ;

白蟻 (等翅目 (*Isoptera*)) , 例如 *Calotermes flavicollis* ,

Leucotermes flavipes，黃胸散白蟻 (*Reticulitermes flavipes*)，*Reticulitermes lucifugus*，及 *Termes natalensis*；

直翅目昆蟲 (*Orthoptera*)，例如家蟋蟀 (*Acheta domestica*)，東方蜚蠊 (*Blatta orientalis*)，德國小蠊 (*Blattella germanica*)，歐洲球蝮 (*Forficula auricularia*)，歐洲螻蛄 (*Gryllotalpa gryllotalpa*)，飛蝗 (*Locusta migratoria*)，雙帶蚱蜢 (*Melanoplus bivittatus*)，赤腿蚱蜢 (*Melanoplus femur-rubrum*)，墨西哥蚱蜢 (*Melanoplus mexicanus*)，遷徙蚱蜢 (*Melanoplus sanguinipes*)，落磯山蚱蜢 (*Melanoplus spretus*)，紅翅蝗 (*Normadacris septemfasciata*)，美洲大蠊 (*Periplaneta americana*)，美洲蚱蜢 (*Schistocerca americana*)，*Schistocerca peregrina*，*Stauronotus maroccanus*，及溫室蟋螽 (*Tachycines asynamorus*)；

蛛形綱 (*Arachnoidea*)，如蜘蛛 (蜱蟎目 (*Acarina*))，例如隱喙蜱科 (*Argasidae*)，蜱科 (*Ixodidae*)，及疥蟎科 (*Sarcoptidae*)，如美洲花蜱 (*Amblyomma americanum*)，*Amblyomma variegatum*，波斯隱喙蜱 (*Argas persicus*)，具環方頭蜱 (*Boophilus annulatus*)，*Boophilus decoloratus*，微小牛蜱 (*Boophilus microplus*)，森林革蜱 (*Dermacentor silvarum*)，*Hyalomma truncatum*，羊硬蜱 (*Ixodes ricinus*)，*Ixodes rubicundus*，喙蜱 (*Ornithodoros moubata*)，耳殘喙蜱 (*Otobius megnini*)，雞皮刺蟎 (*Dermanyssus gallinae*)，羊癢蟎 (*Psoroptes ovis*)，*Rhipicephalus appendiculatus*，*Rhipicephalus evertsi*，疥蟎 (*Sarcoptes scabiei*)，及癩蟎科 (*Eriophyidae*)

spp.)，如蘋刺癭蟎(*Aculus schlechtendali*)，橘銹蟎(*Phyllocoptrata oleivora*)，及柑芽癭蟎(*Eriophyes sheldoni*)；跗線蟎科(*Tarsonemidae spp.*)，如*Phytonemus pallidus*及多食跗線蟎(*Polyphagotarsonemus latus*)；細鬚蟎科(*Tenuipalpidae spp.*)，如*Brevipalpus phoenicis*；葉蟎科(*Tetranychidae spp.*)，如朱砂葉蟎(*Tetranychus cinnabarinus*)，*Tetranychus kanzawai*，太平洋紅葉蟎(*Tetranychus pacificus*)，棉紅葉蟎(*Tetranychus telarius*)，及棉葉蟎(*Tetranychus urticae*)，蘋果紅蜘蛛(*Panonychus ulmi*)，橘全爪蟎(*Panonychus citri*)，及草地小爪蟎(*Oligonychus pratensis*)；

蚤目(*Siphonatera*)，例如東方鼠蚤(*Xenopsylla cheopsis*)，蚤屬(*Ceratophyllus spp.*)；

線蟲，包括植物寄生線蟲及土壤線蟲。

植物寄生線蟲包括如根癭(root knot)線蟲，*Meloidogyne hapla*，*Meloidogyne incognita*，*Meloidogyne javanica*，及其他根結線蟲屬(*Meloidogyne*)各種；包囊(cyst)形成之線蟲，*Globodera rostochiensis*，及其他*Globodera*各種；*Heterodera avenae*，大豆異皮線蟲(*Heterodera glycines*)，*Heterodera schachtii*，*Heterodera trifolii*，及其他異皮線蟲屬(*Heterodera*)各種；種子蟲癭(Seed gall)線蟲，蛇墊刃屬(*Anguina*)；莖及葉線蟲，滑刃線蟲屬(*Aphelenchoides*)；螫針(Sting)線蟲，*Belonolaimus longicaudatus*，及其他*Belonolaimus*各種；松樹(Pine)線蟲，*Bursaphelenchus xylophilus*，及其他*Bursaphelenchus*各種；環線蟲，環線蟲屬

(*Criconema*) , *Criconemella* 屬 , 似環線蟲屬 (*Criconemoides*) , *Mesocriconema* 屬 ; 莖及球莖 (bulb) 線蟲 , *Ditylenchus destructor* , 玉米莖線蟲 (*Ditylenchus dipsaci*) , 及其他雙墊刃屬 (*Ditylenchus*) 各種 ; 錐子 (Awl) 線蟲 , *Dolichodoros* 屬 ; 螺旋形線蟲 , *Helicotylenchus multicinctus* 及其他 *Helicotylenchus* 各種 ; 鞘及類鞘線蟲 , *Hemicycliophora* 屬及 *Hemicriconemoides* 屬 ; *Hirshmanniella* 屬 ; 槍 (Lance) 線蟲 , *Hoploaimus* 屬 ; 假根癭 (false rootknot) 線蟲 , *Nacobbus* 屬 ; 針線蟲 , *Longidorus elongatus* 及其他 *Longidorus* 各種 ; 大頭針 (Pin) 線蟲 , 擬墊刃屬 (*Paratylenchus*) ; 損害 (Lesion) 線蟲 , *Pratylenchus neglectus* , 穿根線蟲 (*Pratylenchus penetrans*) , *Pratylenchus curvatus* , *Pratylenchus goodeyi* 及其他草地墊刃線蟲屬 (*Pratylenchus*) 各種 ; 掘穴 (Burrowing) 線蟲 , 掘穴線蟲 (*Radopholus similis*) 及其他內侵線蟲屬 (*Radopholus*) 各種 ; 腎臟形線蟲 , *Rotylenchus robustus* 及其他 *Rotylenchus* 各種 ; *Scutellonema* 屬 ; 粗短 (Stubby) 根線蟲 , *Trichodoros primitivus* 及其他 *Trichodoros* 各種 , *Paratrachodoros* 屬 ; 短小 (Stunt) 線蟲 , *Tylenchorhynchus claytoni* , *Tylenchorhynchus dubius* 及其他 *Tylenchorhynchus* 各種 ; 橘 (Citrus) 線蟲 , 墊刃線蟲屬 (*Tylenchulus*) ; 短劍 (Dagger) 線蟲 , *Xiphinema* 屬 ; 及其他植物寄生線蟲種類。

在本發明之一個較佳具體實施例中 , 式 I 化合物用於控制昆蟲或蜘蛛 , 特別是鱗翅目 (Lepidoptera) , 鞘翅目

(Coleoptera)及同翅目(Homoptera)之昆蟲及蟬蟎目(Acarina)之蜘蛛。根據本發明之式I化合物特別可用於控制鱗翅目及同翅目之昆蟲。

式I化合物或包含彼等之除害組合物可用於保護生長之植物及作物避免動物害蟲，特別是昆蟲，蟬蟎(acaridae)或蜘蛛之侵襲或侵害，由使植物/作物接觸除害有效量之式I化合物。術語「作物」表生長及收穫之作物。

動物害蟲，即昆蟲，蜘蛛，及線蟲，植物，植物生長之土壤或水可以此技藝中已知之任何施用方法與本發明化合物I或含有彼等之組合物接觸。「接觸」包括直接接觸(化合物/組合物直接施加於動物害蟲或植物，典型於植物之葉，莖，或根)及間接接觸(化合物/組合物施加於動物害蟲或植物之場所)。

此外，可由目標害蟲，其食物供給，或其場所接觸除害有效量之式I化合物而控制動物害蟲。施用可在場所，生長作物，或收穫作物為害蟲侵害前或後進行。

「場所」意為一種害蟲或寄生蟲生長或可能生長之棲息處，繁殖處，植物，種子，土壤，區域，物質，或環境。

適合用於本發明方法之有效量可依特定式I化合物，目標害蟲，施用方法，施用時間，天氣情況，動物害蟲棲息處等變化。一般而言，用於處理作物植物，根據本發明之化合物I及/或組合物之施用率可在每公頃約0.1至約4000克，較佳每公頃約25至約600克，更佳每公頃約50至約500克範圍內。用於處理種子，典型施用率為每公斤種子約1至約

500克，較佳每公斤種子約2至約300克，更佳每公斤種子約10至約200克。在保護物質中，慣用施用率為例如所處理物質每立方公尺約0.001克至約2000克，較佳約0.005克至1000克活性化合物。

化合物I或包含彼等之除害組合物可以例如溶液，乳液，微乳液，懸浮液，可流動濃縮物，粉塵(dusts)，粉末，糊，及顆粒之形式使用。使用形式依特定目的而定；在任何情況，應確保根據本發明之化合物之細微及均勻分布。

對抗動物害蟲，即昆蟲，蜘蛛，或線蟲之除害組合物含有該量之至少一種通式I之化合物或I之農業上有用鹽及一般用於調配除害組合物之輔助劑。

調配物係以已知方式製備，例如由活性成份與溶劑及/或載劑摻合，若需要，使用乳化劑及分散劑，若水用作稀釋劑，亦可使用其他有機溶劑作為輔助溶劑。適合之輔助劑主要為：溶劑，如芳烴(例如二甲苯)，氯化芳烴(例如氯苯)，石蠟(例如礦油部份)，醇(例如甲醇，丁醇)，酮(例如環己酮)，胺(例如乙醇胺，二甲基甲醯胺)，及水；載劑，如碎天然礦物(例如高嶺土，黏土，滑石，白堊)及碎合成礦物(例如高度分散之矽石，矽酸鹽)；乳化劑，如非離子及陰離子乳化劑(例如聚氧乙烯脂肪醇醚，烷基磺酸鹽，及芳基磺酸鹽)，及分散劑，如木質素-亞硫酸鹽廢液，及甲基纖維素。

適合之表面活性劑為木質磺酸，萘磺酸，酚磺酸，二丁基萘磺酸，烷基芳基磺酸，烷基硫酸，烷基磺酸，脂肪醇硫酸，及脂肪酸之鹼金屬，鹼土金屬，及銨鹽，及硫酸化

脂肪醇二醇醚之鹼金屬，鹼土金屬，及銨鹽，以及磺酸化萘及萘衍生物與甲醛之縮合物，萘或萘磺酸與酚或甲醛之縮合物，聚氧乙烯辛基酚醚，乙氧基化異辛基酚，辛基酚，壬基酚，烷基酚聚二醇醚，三丁基苯基聚二醇醚，烷基芳基聚醚醇，異十三醇，脂肪醇/環氧乙烷縮合物，乙氧基化蓖麻油，聚氧乙烯烷基醚，乙氧基化聚氧丙烯，月桂醇聚二醇醚縮醛，山梨糖醇酯，木質素-亞硫酸鹽廢液，及甲基纖維素。

適合用於製備直接噴灑之溶液，乳液，糊，或油分散液者為中至高沸點之礦油部份，如煤油或柴油，煤焦油，及植物或動物來源之油，脂族，環狀，及芳族烴，例如甲苯，二甲苯，石蠟，四氫萘，烷基化萘或其衍生物，甲醇，乙醇，丙醇，丁醇，氯仿，四氯化碳，環己醇，環己酮，氯苯，異佛爾酮，強極性溶劑，例如二甲基甲醯胺，二甲亞風，N-甲基吡咯啉酮，及水。

粉末，可散布之物質，及粉塵可由混合或共同研磨活性物質與一種固體載劑而製備。

顆粒，例如塗覆之顆粒，壓縮之顆粒，浸漬之顆粒，及均質之顆粒，可由活性成份黏合於固體載劑而製備。固體載劑之實例為礦土，如矽石，矽膠，矽酸鹽，滑石，高嶺土，阿塔黏土(attaclay)，石灰，石灰石，白堊，膠塊黏土(bole)，黃土，黏土，白雲石，矽藻土，硫酸鈣，硫酸鎂，氧化鎂，碎合成物質，肥料，例如，硫酸銨，磷酸銨，硝酸銨，脲，植物來源之產物，如穀粉，樹皮粉，木粉，及

堅果殼粉，纖維素粉末，及其他固體載劑。

本發明調配物或組合物包括一種本發明之式I化合物(或其合併物)混合一或多種農藝上可接受之惰性，固體或液體載劑。該等組合物含有除害有效量之該化合物，該量可依特定化合物，目標害蟲，及使用方法而變化。

一般而言，調配物包含0.01至95重量%，較佳0.1至90重量%活性成份。活性成份係以90%至100%，較佳95%至100%(根據NMR光譜)純度使用。

下列為調配物之實例：

- I. 5份重量之根據本發明化合物與95份重量之細微粉碎之高嶺土密切混合。獲得一種包含5重量%活性成份之粉塵。
- II. 30份重量之根據本發明之化合物與92份重量之粉碎矽膠及8份重量之石蠟油(已噴灑於矽膠表面)之混合物密切混合。獲得一種具有良好黏著性質之活性成份之調配物(包含23重量%活性成份)。
- III. 10份重量之根據本發明之化合物溶於包含90份重量之二甲苯，6份重量之8至10莫耳環氧乙烷及1莫耳油酸N-一乙醇醯胺之加成物，2份重量之十二基苯磺酸鈣，及2份重量之40莫耳環氧乙烷及1莫耳蓖麻油之加成物之混合物中(包含9重量%活性成份)。
- IV. 20份重量之根據本發明之化合物溶於包含60份重量之環己酮，30份重量之異丁醇，5份重量之7莫耳環氧乙烷及1莫耳異辛基酚之加成物，及5份重量之40莫耳

環氧乙烷及1莫耳蓖麻油之加成物之混合物中(包含16重量%活性成份)。

- V. 80份重量之根據本發明之化合物與3份重量之二異丁基萘- α -磺酸鈉，10份重量之亞硫酸鹽廢液中木質磺酸鈉鹽，及7份重量之粉碎矽膠徹底混合，混合物在一個錘磨機中研磨(包含80重量%活性成份)。
- VI. 90份重量之根據本發明之化合物與10份重量之N-甲基- α -吡咯啉酮混合，獲得一種溶液，其適合以微滴形式使用(包含90重量%活性成份)。
- VII. 20份重量之根據本發明之化合物溶於包含40份重量之環己酮，30份重量之異丁醇，20份重量之7莫耳環氧乙烷及1莫耳異辛基酚之加成物，及10份重量之40莫耳環氧乙烷及1莫耳蓖麻油之加成物之混合物中。該溶液倒入100,000份重量之水中，並細微分布於其中，獲得一種包含0.02重量%活性成份之分散水液。
- VIII. 20份重量之根據本發明之化合物與3份重量之二異丁基萘- α -磺酸鈉，17份重量之亞硫酸鹽廢液中木質磺酸鈉鹽，及60份重量之粉碎矽膠徹底混合，混合物在一個錘磨機中研磨。混合物細微分布於20,000份重量之水中，獲得一種包含0.1重量%活性成份之噴灑混合物。

活性化合物可如此使用，以調配物形式使用，或以其製備之使用形式使用，例如以直接噴灑溶液，粉末，懸浮液或分散液，乳液，油分散液，糊，粉塵，可展布物質，或

顆粒之形式，以噴灑，霧化，撒，散布，或傾倒方式使用。使用形式完全依據所欲目的而定；意圖確保在任何情況下可最佳分布根據本發明之活性成份。

水性使用形式可由乳液濃縮物，糊，或可潤濕粉末(可噴灑粉末，油分散液)加水而製備。為製備乳液，糊，或油分散液，該物質，如此或溶於一種油或溶劑中，可以一種潤濕劑，膠黏劑，分散劑，或乳化劑於水中均質化。或者，可製備包含活性物質，潤濕劑，膠黏劑，分散劑，或乳化劑，及若適合，溶劑或油之濃縮物，該濃縮物適合以水稀釋。

現成可用產品中活性成份之濃度可在廣泛範圍內變化。一般而言由0.0001至10%，較佳由0.01至1%。

活性成份亦可以超低體積方法(ULV)成功地使用，可使用包含大於95重量%活性成份之調配物，或甚至使用無添加劑之活性成份。

根據本發明使用之組合物亦可含有其他活性成份，例如其他除害劑，殺昆蟲劑，除草劑，殺真菌劑，或殺細菌劑，肥料，如硝酸銨，尿素，鉀鹼，及過磷酸鹽，植物毒劑及植物生長調節劑，安全劑，及殺線蟲劑。這些其他成份可與上述組合物依序或合併使用，若適合，亦可僅在使用前加入(槽混合)。例如，植物可在以其他活性成份處理前或後噴灑一種本發明之組合物。

這些劑可與根據本發明使用之劑以1：10至10：1之重量比例混合。化合物I或包含彼等之組合物以除害劑之使用形

式與其他除害劑混合通常造成較廣泛除害作用範圍。

下列除害劑名單可與式I化合物一起使用，係用於例示可能之組合，但並非用於限制：

有機磷酸鹽：歐殺松 (Acephate)，谷速松 (Azinphos-methyl)，陶斯松 (Chlorpyrifos)，氯芬文松 (Chlorfenvinphos)，大利松 (Diazinon)，二氯松 (Dichlorvos)，雙特松 (Dicrotophos)，大滅松 (Dimethoate)，二硫松 (Disulfoton)，愛殺松 (Ethion)，撲滅松 (Fenitrothion)，芬殺松 (Fenthion)，異嘮殺松 (Isoxathion)，馬拉松 (Malathion)，達馬杉 (Methamidophos)，滅大松 (Methidathion)，甲基巴拉松 (Parathion)，美文松 (Mevinphos)，亞素靈 (Monocrotophos)，滅多松 (Oxydemeton-methyl)，雙氧磷 (Paraoxon)，巴拉松 (Para-thion)，賽達松 (Phenthoate)，裕必松 (Phosalone)，益滅松 (Phosmet)，福賜米松 (Phosphamidon)，福瑞松 (Phorate)，巴賽松 (Phoxim)，亞特松 (Pirimiphos-methyl)，佈飛松 (Profenofos)，普硫松 (Prothiofos)，殺普松 (Sulprophos)，三落松 (Triazophos)，三氯松 (Trichlorfon)；

胺基甲酸酯：阿蘭克 (Alanycarb)，本夫克 (Benfuracarb)，加保利 (Carbaryl)，丁基加保扶 (Carbosulfan)，芬諾西克 (Fenoxycarb)，夫硫克 (Furathiocarb)，引多殺克 (Indoxacarb)，滅賜克 (Methiocarb)，納乃得 (Methomyl)，歐殺滅 (Oxamyl)，比加普 (Pirimicarb)，安丹 (Propoxur)，硫地克 (Thiodicarb)，三阿札美 (Triazamate)；

擬除蟲菊酯 (Pyrethroids)：畢芬寧 (Bifenthrin)，西福寧

(Cyfluthrin), 賽滅寧 (Cypermethrin), 德它美寧 (Deltamethrin), 伊芬化利 (Esfenvalerate), 伊索芬普克 (Ethofenprox), 芬普寧 (Fenpropathrin), 芬化利 (Fenvalerate), 賽洛寧 (Cyhalothrin), λ -賽洛寧, 百滅寧 (Permethrin), 西拉福芬 (Silaflluofen), τ -福化利 (Fluvalinate), 七氟菊酯 (Tefluthrin), 查洛美寧 (Tralomethrin), ζ -賽滅寧 (Cypermethrin);

節肢動物生長調節劑：a) 幾丁質合成抑制劑：苯甲醯基脲：克福隆 (Chlorfluazuron), 帝福隆 (Diflubenzuron), 福環脲 (Flucyclozuron), 氟芬隆 (Flufenoxuron), 六伏隆 (Hexaflumuron), 祿芬隆 (Lufenuron), 諾華隆 (Novaluron), 得福隆 (Teflubenzuron), 殺蟲隆 (Triflumuron); 布芬淨 (Buprofezin), 戴芬蘭 (Diofenolan), 合賽多 (Hexythiazox), 伊妥喹坐 (Etoxazole), 克芬蟎 (Clofentazine); b) 蛻皮素 (ecdysone) 拮抗劑：鹵芬載 (Halofenozide), 甲氧芬載 (Methoxyfenozide), 得布芬載 (Tebufenozide); c) 類幼年素 (Juvenoids)：比普西芬 (Pyriproxyfen), 甲氧普林 (Methoprene), 芬氧克 (Fenoxycarb); d) 脂質生物合成抑制劑：螺二克芬 (Spirodiclofen);

各種劑：阿巴美丁 (Abamectin), 阿色奎西 (Acequinocyl), 三亞蟎 (Amitraz), 印苦棟子素 (Azadirachtin), 畢芬載 (Bifenazate), 培丹 (Cartap), 克芬那比 (Chlorfenapyr), 殺蟲脒 (Chlordimeform), 西洛美秦 (Cyromazine), 戴芬西隆 (Diafenthiuron), 丁內妥夫 (Dinotofuran), 戴芬蘭 (Diofenolan), 伊曼美丁 (Emamectin), 安殺番 (Endosulfan), 伊希普

(Ethiprole), 芬那札奎(Fenazaquin), 費普尼(Fipronil), 覆滅蟎(Formetanate), 覆滅蟎鹽酸鹽, 羥甲隆(Hydramethylnon), 益達胺(Imidacloprid), 引多殺克(Indoxacarb), 比達本(Pyridaben), 比美卓秦(Pymetrozine), 賜諾殺(Spinosad), 硫, 得布芬比(Tebufenpyrad), 塞美索占(Thiamethoxam), 及硫環蘭(Thiocyclam)。

本發明以下列實例進一步詳細說明。

本發明化合物及中間物以偶合之高性能液態層析/質譜(HPLC/MS), NMR, 或熔點說明特徵。HPLC管柱: RP-18管柱(Merck KgaA, Germany之Chromolith Speed ROD)。溶離: 乙腈+0.1%三氟醋酸(TFA)/水+0.1% TFA以5:95至95:5之比例, 5分鐘內, 於40°C。MS:四極電噴離子化, 80V(正形式)

實例1:(4,5-二氫-4-甲基嘔唑-2-基)-[2-(3-氯-苯基)-1-苯基-乙基]-胺

1.1 1-(2-(3-氯苯基)-1-苯基-乙基)-3-(2-氯-丙基)-脲

72毫克(0.6毫莫耳)2-氯丙基異氰酸酯於THF中分成4份加入116毫克(0.5毫莫耳)2-(3-氯苯基)-1-苯基-乙胺於2毫升THF中, 在0°C於4小時內。溶液在室溫攪拌過夜。在溶劑蒸發及水相處理後, 獲得128毫克(0.36毫莫耳, 73%)所欲脲。

1.2 (4,5-二氫-4-甲基嘔唑-2-基)-[2-(3-氯-苯基)-1-苯基-乙基]-胺

158毫克(0.45毫莫耳)1-(2-(3-氯苯基)-1-苯基-乙基)-3-

(2-氯-丙基)-脲及386毫克(0.9毫莫耳)1,5,7-三氮雜雙環[4.4.0]癸-5-烯-7-甲基聚苯乙烯(TBD-甲基聚苯乙烯, Novabiochem)在1,4-二氧六環中加熱至100°C歷12小時。在聚合物過濾移除及溶劑蒸發後,獲得92毫克(0.31毫莫耳, 69%)所欲胺基嘓啞啞。

實例2: (4,5-二氮-嘓啞啞-2-基)-[2-(4-氯-苯基)-1-苯基-乙基]-胺
2-(4-氯-苯基)-1-苯基-乙胺(1.50克)於THF中之溶液在0°C以2-氯乙基異氰酸酯(0.89克)逐滴處理。在室溫攪拌過夜後,溶劑蒸發,殘餘物溶於二甲氧基乙烷(25毫升)中。DBU(1,8-二氮雜雙環[5.4.0]十一-7-烯)(1.78克)加入,反應混合物在回流下加熱1小時。在矽石上管柱層析,獲得1.3克標題化合物。

實例3: 1-[1-(4-氯苯基)-2-苯基-乙基]-(4,5-二氮嘓啞啞-2-基)-胺

3.1 1-(4-氯苯基)-2-苯基-乙胺

熱壓器(300毫升, hasteloi)裝入1-(4-氯苯基)-2-苯基-乙酮(22克),四氫呋喃(90毫升),鈷活化之雷氏(Raney)鎳(5克)及氫(45克)。熱壓器以氫沖洗,加熱至70°C。氫在此溫度加入達150巴,反應溫度增加至110°C。攪拌過夜後,反應混合物經矽石過濾,以THF洗。水相以萃取入二氯甲烷處理,獲得純胺,83%產率。

3.2 1-氯-4-(1-異硫氰酸基-1-苯基乙-2-基)苯

1-(4-氯苯基)-2-苯基-乙胺(4.86克)加入硫光氣(2.88克)於二氯甲烷(40毫升),碳酸鉀(8.56克),及水(10毫升)中之混合物內。混合物攪拌過夜。然後,反應混合物

倒入水中，水相以二氯甲烷萃取，獲得5.67克(99%)異硫氰酸酯化合物。

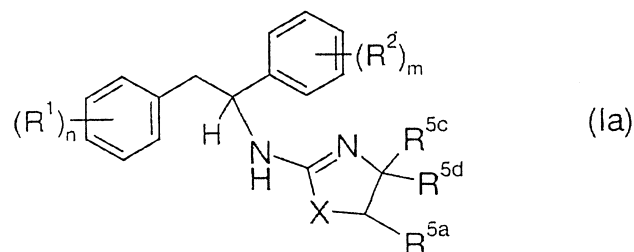
3.3 1-[1-(4-氯苯基)-2-苯基乙基]-3-(2-羥基乙基)-硫脲

1-氯-4-(1-異硫氰酸基-2-苯基乙基)苯(0.50克)於氯仿(30毫升)中之溶液以乙醇胺(0.11克)處理，在室溫攪拌過夜。在矽石上層析，獲得產物(0.30克)。

3.4 1-[1-(4-氯苯基)-2-苯基-乙基]-(4,5-二氫噻唑-2-基)-胺 1-[1-(4-氯苯基)-2-苯基乙基]-3-(2-羥基乙基)-硫脲 (0.30克)以濃鹽酸回流，在室溫繼續攪拌過夜。鹽酸相由生成之油傾析移除。殘餘物溶於醋酸乙酯中，有機相以碳酸鉀水溶液及水洗。在乾燥及溶劑蒸發後，獲得0.14克1-[1-(4-氯苯基)-2-苯基-乙基]-(4,5-二氫噻唑-2-基)-胺。

通式 Ia 之化合物(實例 4 至 44)可以此製備。這些化合物之光譜數據列於表 1。

表 1：



| 實例 | (R ¹) _n | (R ²) _m | R ^{5a} | R ^{5c} | R ^{5d} | X | 物理化學數據 (熔點 [°C]; ¹ H-NMR (CDCl ₃): δ [ppm]; HPLC-MS: RT [分鐘], 分子質量 |
|----|--------------------------------|--------------------------------|-------------------------------|-----------------|-----------------|---|---|
| 1 | 3-Cl | - | H | CH ₃ | H | O | 2.861 315 [M+H] ⁺ |
| 2 | 4-F | - | H | H | H | O | 141-143 °C |
| 3 | - | 4-Cl | H | H | H | S | 3.05 (mc), 3.25 (t), 3.85 (t), 4.90 (mc), 7.0-7.3 (m) |
| 4 | - | - | H | H | H | O | 2.585 267 [M+H] ⁺ |
| 5 | 3-Cl | - | H | H | H | S | 2.9 (mc), 3.1 (mc), 3.65 (mc), 4.9 (mc), 7.1-7.4 (m) |
| 6 | - | - | H | H | H | S | 114-116 °C |
| 7 | 3-CH ₃ | - | H | H | H | S | 2.25 (s), 3.0 (mc), 3.5-4.9 (m), 5.1 (mc), 7.0-7.5 (m) |
| 8 | 3-Cl | - | H | n- 丁基 | H | S | 0.7-0.9 (m), 1.0-1.4 (m), 2.7-3.3 (m), 3.9 (mc), 4.9 (mc), 7.1- 7.4 (m) |
| 9 | 3-Cl | - | H | 苯甲基 | H | S | 2.4-3.1 (m), 4.2 (mc), 4.9 (mc), 6.9- 7.4 (m) |
| 10 | 3-Cl | - | CH ₃ | CH ₃ | H | S | 0.9-1.1 (m), 2.9 (mc), 3.2-3.8 (m), 4.9 (mc), 7.1-7.4 (m) |
| 11 | 3-Cl | - | C ₆ H ₅ | CH ₃ | H | S | 1.0 (mc), 2.95 (mc), 3.95 (mc), 4.4(mc), 5.0 (mc), 7.15-7.45 (m) |
| 12 | 3-Cl | - | C ₆ H ₅ | H | H | S | 2.95 (mc), 3.7 (mc), 4.0 (mc), 4.9-5.15 (m), 7.1-7.4 (m), 7.5 (br s) |
| 13 | - | - | C ₆ H ₅ | H | H | S | 2.95 (mc), 3.7 (mc), 4.05 (mc), 4.9-5.1 (m), 7.15-7.4 (m), 7.5 (br s) |

| 實例 | (R ¹) _n | (R ²) _m | R ^{5a} | R ^{5c} | R ^{5d} | X | 物理化學數據 (熔點 [°C]; ¹ H-NMR (CDCl ₃): δ [ppm]; HPLC-MS: RT [分鐘], 分子質量 |
|----|--------------------------------|--|-------------------------------|-----------------|-----------------|---|---|
| 14 | 2-F | - | H | H | H | S | 3.1 (mc), 3.2 (t), 3.8 S (mc), 4.9 (t), 6.9-7.35 (m) |
| 15 | 4-Cl | - | H | H | H | S | 3.0-3.4 (m), 3.85 (mc), 4.75 (mc), 6.9- 7.4 (m) |
| 16 | 3-CH ₃ | - | CH ₃ | H | H | S | 1.3 (d), 2.3 (s), 3.05 (d), 3.5 (mc), 3.9 (mc), 4.9 (mc), 6.8- 7.4 (m) |
| 17 | 3-CH ₃ | - | C ₆ H ₅ | H | H | S | 2.3 (s), 3.1 (mc), 3.95 (mc), 4.25 (mc), 4.85-5.1 (m), 6.8- 7.35 (m) |
| 18 | 3-CH ₃ | - | H | H | H | S | 2.3 (s), 3.1 (mc), 3.3 (mc), 3.9 (mc), 4.8 (mc), 6.8-7.3 (m) |
| 19 | 3-F | - | H | H | H | S | 2.85-3.35 (m), 3.85 (mc), 4.75 (mc), 6.8- 7.4 (m) |
| 20 | 3-Cl, 4-F | - | H | H | H | S | 2.90 (mc), 3.15 (t), 3.65 (t), 4.85 (mc), 7.2-7.5 (m) |
| 21 | 3-F, 4-F | - | H | H | H | S | 103-105 °C |
| 22 | 4-Br | - | H | H | H | S | 2.9 (mc), 3.1 (t), 3.65 (t), 4.9 (mc), 7.15-7.4 (m) |
| 23 | - | 3-OCH ₃ , 5-OCH ₃ | H | H | H | O | - |
| 24 | 3-Cl | - | H | H | H | O | 112-113 °C |
| 25 | 4-CH ₃ | - | H | H | H | O | - |
| 26 | 2-Br | - | H | H | H | O | - |
| 27 | 2-Cl, 4-Cl | - | H | H | H | O | - |
| 28 | - | 3-Cl, 4-Cl | H | H | H | O | - |
| 29 | - | - | H | CH ₃ | CH ₃ | O | 2.722 295 [M+H] ⁺ |

| 實例 | (R ¹) _n | (R ²) _m | R ^{5a} | R ^{5c} | R ^{5d} | X | 物理化學數據 (熔點 [°C]; ¹ H-NMR (CDCl ₃): δ [ppm]; HPLC-MS: RT [分鐘], 分子質量 |
|----|--------------------------------|--------------------------------|-----------------|-------------------------------|-----------------|---|---|
| 30 | - | - | CH ₃ | H | H | O | 2.706 281 [M+H] ⁺ |
| 31 | - | - | H | C ₂ H ₅ | H | O | 2.779 295 [M+H] ⁺ |
| 32 | - | - | CH ₃ | CH ₃ | H | O | 2.826 295 [M+H] ⁺ |
| 33 | - | - | H | CH ₃ | H | O | 2.660 281 [M+H] ⁺ |
| 34 | 2-F | - | H | H | H | O | 157-158 °C |
| 35 | 3-F, 5-F | - | H | H | H | O | 129-130 °C |
| 36 | 3-F | - | H | H | H | O | 117-118 °C |
| 37 | 3-Cl | - | H | CH ₃ | CH ₃ | O | 2.890 329 [M+H] ⁺ |
| 38 | 3-Cl | - | CH ₃ | H | H | O | 2.912 315 [M+H] ⁺ |
| 39 | 3-Cl | - | H | C ₂ H ₅ | H | O | 2.992 329 [M+H] ⁺ |
| 40 | 3-Cl | - | CH ₃ | CH ₃ | H | O | 2.016 329 [M+H] ⁺ |
| 41 | 3-Cl, 4-Cl | - | H | H | H | O | 168-169 °C |
| 42 | 2-Cl | - | H | H | H | O | 141-143 °C |
| 43 | 3-Br | - | H | H | H | O | 110-111 °C |
| 44 | 2-Cl, 6-Cl | - | H | H | H | O | 187-188 °C |
| 50 | - | - | H | H | H | S | 114-116°C |
| 51 | 4-CH ₃ | - | H | H | H | S | 2.25 (s), 3.0 (mc), 3.5-3.9 (m), 5.1 (mc), 7.05-7.45 (m)* |
| 52 | 3-Br | - | H | H | H | S | 2.9 (mc), 3.1 (t), 3.65 (t), 4.9 (mc), 7.15- 7.4 (m)* |
| 53 | 2-Cl | 4-F | H | H | H | S | 120-122°C |
| 54 | 2-CH ₃ | - | H | H | H | S | 2.2 (s), 3.1 (mc), 3.2 (t), 3.9 (t), 4.9 (t), 7.0-7.35 (m) |
| 55 | 4-OCH ₃ | 4-OCH ₃ | H | H | H | S | 3.0-3.2 (m), 3.25 (t), 3.75-3.85 (m), 4.5 (t), 6.65-7.2 (m) |

| 實例 | (R ¹) _n | (R ²) _m | R ^{5a} | R ^{5c} | R ^{5d} | X | 物理化學數據 (熔點 [°C]; ¹ H-NMR (CDCl ₃): δ [ppm]; HPLC-MS: RT[分鐘], 分子質量 |
|----|--------------------------------|---------------------------------------|-----------------|-----------------|-----------------|---|--|
| 56 | 4-Br | - | H | H | H | S | 3.0-3.15 (m), 3.85 (t), 4.85 (t), 6.9-7.3 (m) |
| 57 | - | 4-CH ₃ | H | H | H | S | 120-123°C |
| 58 | - | 3-CH ₃ | H | H | H | S | 98-100°C |
| 59 | 3-CF ₃ | - | H | H | H | S | 3.1 (mc), 3.25 (mc), 3.9 (t), 4.9 (t), 7.2-7.45 (m) |
| 60 | 2-Cl, 4-F | - | H | H | H | S | 3.0 (mc), 3.15 (t), 3.65 (t), 4.95 (mc), 7.15-7.4 (m)* |
| 61 | 3-Cl, 5-Cl | - | H | H | H | S | 110-111°C |
| 62 | 2-F, 3-F, 4-F, 5-F, 6-F | - | H | H | H | S | 143-145°C |
| 63 | 3-(m-F-Ph) | - | H | H | H | S | 376 [M+H] ⁺ |
| 64 | 3-(p-OCH ₃ -Ph) | - | H | H | H | S | 2.95 (mc), 3.1 (t), 3.7 (mc), 3.8 (s), 4.95 (mc), 7.0-7.45 (m)* |
| 65 | - | 2-Cl, 6-Cl | H | H | H | S | 134-136°C |
| 66 | 3-CH ₃ | 2-Cl, 3-Cl | H | H | H | S | 158-159°C |
| 67 | 3-CH ₃ | 2-Cl, 6-Cl | H | H | H | S | 148-150°C |
| 68 | - | 4-C ₂ H ₅ | H | H | H | S | 120-121°C |
| 69 | - | 4-S-CH ₃ | H | H | H | S | 60-62°C |
| 70 | - | 2-Cl, 3-Cl | H | H | H | S | 151-152°C |
| 71 | 3-Cl | 3-Cl | H | H | H | S | 351 [M+H] ⁺ |
| 72 | - | 3-O-CH ₃ | H | H | H | S | 312 [M+H] ⁺ |
| 73 | - | 2-CH ₃ , 4-CH ₃ | H | H | H | S | 2.2 (s), 2.3 (s), 3.05 (mc), 3.2 (t), 3.85 (t), 5.05(t), 6.9-7.3 (m) |
| 74 | - | 4-O-第三丁基 | H | H | H | S | 1.3 (s), 3.0-3.15 (m), 3.25 (t), 3.9 (t), 4.9 (t), 6.9-7.2 (m) |
| 75 | - | 3-O-C ₂ H ₅ | H | H | H | S | 1.4 (t), 3.05 (mc), 3.2 (mc), 3.9 (mc), 4.9 (t), 6.7-7.7 (m) |

| 實例 | (R ¹) _n | (R ²) _m | R ^{5a} | R ^{5c} | R ^{5d} | X | 物理化學數據 (熔點 [°C]; ¹ H-NMR (CDCl ₃): δ [ppm]; HPLC-MS: RT[分鐘], 分子質量 |
|----|--------------------------------|-----------------------------------|-----------------|-----------------|-----------------|---|--|
| 76 | - | 2-O-C ₂ H ₅ | H | H | H | S | 1.45 (t), 3.05-3.25 (m), 3.9 (t), 4.05 (t), 5.1 (t), 6.8-7.2 (m) |
| 77 | - | 2-C ₂ H ₅ | H | H | H | S | 1.1 (t), 2.55 (mc), 3.1 (t), 3.2 (t), 3.9 (t), 5.2 (t), 7.1-7.2 (m) |
| 78 | 2-Cl | - | H | H | H | S | 3.15(mc), 3.8(mc), 4.95(t), 7.1-7.35(m) |
| 79 | 3-CH ₃ | 4-C ₂ H ₅ | H | H | H | S | 1.1 (t), 2.2 (s), 2.55 (mc), 2.7-2.95 (m), 3.1 (t), 3.65 (t), 4.85 (mc), 7.0-7.15 (m)* |
| 80 | 3-CH ₃ | 4-S-CH ₃ | H | H | H | S | 112-114°C |
| 81 | - | 2-Cl | H | H | H | S | 101-105°C |
| 82 | - | 3-Cl | H | H | H | S | 95-97°C |
| 83 | 3-CH ₃ | 2-Cl | H | H | H | S | 104-107°C |
| 84 | - | 2-O-CH ₃ | H | H | H | S | 3.1 (mc), 3.2 (t), 3.85 (mc), 5.0 (t), 6.85- 7.2 (m) |
| 85 | 3-CH ₃ | 4-Cl | H | H | H | S | 143-146°C |
| 86 | - | 2-F | H | H | H | S | 102-103°C |
| 87 | - | 4-F | H | H | H | S | 122-123°C |
| 88 | 3-CH ₃ | 2-CH ₃ | H | H | H | S | 128-130°C |
| 89 | 3-CH ₃ | 3-CH ₃ | H | H | H | S | 2.25 (s), 2.35 (s), 3.0 (mc), 3.2 (mc), 3.9(mc), 4.9 (t), 6.8- 7.2 (m) |
| 90 | - | 3-F | H | H | H | S | 119-120°C |
| 91 | - | 2-Br | H | H | H | S | 3.1 (mc), 3.3 (mc), 3.9 (t), 4.95 (mc), 7.2-7.7 (m) |
| 92 | - | 3-Br | H | H | H | S | 3.1(mc), 3.35(mc), 3.85(mc), 4.35(mc), 7.2-7.5(m) |
| 93 | 3-CF ₃ | - | H | H | H | O | 121-123°C |

| 實例 | (R ¹) _n | (R ²) _m | R ^{5a} | R ^{5c} | R ^{5d} | X | 物理化學數據 (熔點[°C]; ¹ H-NMR (CDCl ₃): δ [ppm]; HPLC-MS: RT [分鐘], 分子質量 |
|-----|--|---|-----------------|-----------------|-----------------|---|--|
| 94 | - | 2-CH ₃ , 4-第三丁基 | H | H | H | S | 258-260°C (HCl-鹽) |
| 95 | - | 2-CH ₃ , 4-O-CH ₃ , 5-CH ₃ | H | H | H | | 124-126°C |
| 96 | - | 2-Cl, 3-Cl, 4-O-CH ₃ | H | H | H | S | 182-184°C |
| 97 | - | 4-O-CH ₃ | H | H | H | S | 2.8-3.0 (m), 3.15 (t), 3.65 (mc), 4.8 (mc), 7.1-7.2 (m)* |
| 98 | 3-CH ₃ | 3-Cl | H | H | H | S | 2.2 (s), 2.8-2.95 (m), 3.65 (mc), 4.85 (mc), 7.15-7.4 (m)* |
| 99 | 3-CH ₃ | 2-O-CH ₃ | H | H | H | S | 2.25 (s), 2.65-2.85 (m), 3.1 (t), 3.65 (t), 3.8 (s), 5.2 (mc), 6.9- 7.2 (m) * |
| 100 | 3-CH ₃ | 4-O-CH ₃ | H | H | H | S | 2.25 (s), 2.75-2.95 (m), 3.1 (t), 3.65 (t), 4.8 (mc), 5.75 (s), 6.8-7.2 (m)* |
| 101 | 3-CH ₃ | 3-O-CH ₃ | H | H | H | S | 2.25 (s), 2.8-2.95 (m), 3.1 (t), 3.7 (mc), 4.85 (mc), 6.75-7.2 (m)* |
| 102 | 3-CH ₃ | 2-Cl, 3-Cl | H | H | H | O | 203-206°C |
| 103 | 3-O-CH ₃ , 5-O-CH ₃ | - | H | H | H | S | 2.675 343[M+H] ⁺ |
| 104 | - | 4-Br | H | H | H | S | 3.1 (mc), 3.35 (mc), 3.9 (mc), 4.35 (mc), 7.2-7.5 (m) |
| 105 | - | 3-O-CH ₂ -C ₆ H ₅ | H | H | H | S | 2.95 (mc), 3.2 (t), 3.8 (mc), 4.8 (t), 5.2 (mc), 6.5-7.4 (m) |
| 106 | 3-CH ₃ | 2-F | H | H | H | S | 2.2 (s), 2.8-2.95 (m), 3.15 (t), 5.2 (mc), 6.95-7.4 (m)* |

| 實例 | (R ¹) _n | (R ²) _m | R ^{5a} | R ^{5c} | R ^{5d} | X | 物理化學數據 (熔點 [°C]; ¹ H-NMR (CDCl ₃): δ [ppm]; HPLC-MS: RT [分鐘], 分子質量 |
|-----|--------------------------------|---|-----------------|-----------------|-----------------|---|---|
| 107 | 3-CH ₃ | 3-F | H | H | H | S | 205-207°C |
| 108 | - | 2-(O-2-丁烯基) | H | H | H | S | 1.7 (mc), 2.7(mc), 2.9 (mc), 3.1 (t), 3.6 (t), 4.45-4.55 (m), 5.2 (mc), 5.7-5.9 (m), 6.9(mc), 7.1-7.3 (m)* |
| 109 | - | 2-O-CH ₃ , 3-O-CH ₃ | H | H | H | S | 109-113°C |
| 110 | - | 2-(S-[p-Cl- C ₆ H ₄]) | H | H | H | S | 2.8-2.9 (m), 3.1 (t), 3.6 (mc), 5.45 (mc), 7.15-7.6 (m)* |
| 111 | - | 2-O-CH ₂ -C ₆ H ₅ , 3-O-CH ₃ | H | H | H | S | 126-131°C |
| 112 | - | 2-CH ₃ , 3-C ₆ H ₅ | H | H | H | S | 172-174°C |
| 113 | - | 2-CF ₃ , 3-C ₆ H ₅ | H | H | H | S | 167-169°C |
| 114 | - | 2-F, 3-F | H | H | H | S | 103-106°C |
| 115 | - | 2-CH ₃ , 3-F | H | H | H | S | 137-139°C |
| 116 | - | 2-F, 3-CF ₃ | H | H | H | S | 95-98°C |
| 117 | 3-CH ₃ | 4-F | H | H | H | S | 2.3 (s), 3.0 (mc), 3.25 (t), 3.9 (t), 4.9 (mc), 6.8-7.2 (m) |
| 118 | 3-CH ₃ | 4-CH ₃ | H | H | H | S | 107-109°C |
| 119 | 3-CH ₃ | 2-O-CH ₃ , 3-O-CH ₃ | H | H | H | S | 126-129°C |
| 120 | 3-CH ₃ | 2-(O-2-丁烯基) | H | H | H | S | 88-93°C |
| 121 | - | 2-CH ₃ , 3-CH ₃ | H | H | H | S | 116-120°C |
| 122 | 3-CH ₃ | 2-F, 3-F | H | H | H | S | 94-97°C |
| 123 | 3-CH ₃ | 2-CH ₃ , 3-CH ₃ | H | H | H | S | 124-127°C |
| 124 | - | 2-Cl, 3-CF ₃ | H | H | H | S | 121-123°C |
| 125 | 3-CH ₃ | - | H | H | H | O | 123-124°C |
| 126 | - | 2-CH ₃ , 3-CF ₃ | H | H | H | S | 133-136°C |
| 127 | 3-CH ₃ | 3-(O-[對-第三丁基- C ₆ H ₄]) | H | H | H | S | 1.35 (s), 2.3(s), 3.0 (t), 3.2 (t), 3.9(t), 4.9 (mc), 6.8-7.35 (m) |

| 實例 | (R ¹) _n | (R ²) _m | R ^{5a} | R ^{5c} | R ^{5d} | X | 物理化學數據 (熔點 [°C]; ¹ H-NMR (CDCl ₃): δ [ppm]; HPLC-MS: RT[分鐘], 分子質量 |
|-----|---------------------------------------|---------------------------------------|-----------------|-----------------|-----------------|---|--|
| 128 | 3-CH ₃ | 3-O-CF ₃ | H | H | H | S | 2.2 (s), 2.8-2.95 (mc), 3.15 (t), 3.65 (t), 4.9 (mc), 6.95-7.4 (m)* |
| 129 | - | 2-O-(CH ₂ - 萘基) | H | H | H | S | 2.6 (mc), 2.8 (mc), 3.1(t), 3.6 (t), 5.25 (mc), 5.6 (mc), 6.75-7.55 (m)* |
| 130 | - | 2-F, 3-Cl | H | H | H | S | 2.8-3.0(m), 3.1(mc),3.7(mc), 5.2(mc),7.2-7.4(m)* |
| 131 | 3-CH ₃ | 2-CH ₃ , 3-F | H | H | H | S | 134-136°C |
| 132 | 3-CH ₃ | 2-F, 3-F ₃ | H | H | H | S | 127-130°C |
| 133 | 3-CH ₃ | 2-Cl, 3-CF ₃ | H | H | H | S | 139-142°C |
| 134 | 3-CH ₃ | 2-F, 3-Cl | H | H | H | S | 111-114°C |
| 135 | 3-CH ₃ | 2-CH ₃ , 3-CF ₃ | H | H | H | S | 129-131°C |
| 136 | 4-CH ₃ | 2-Cl, 3-Cl | H | H | H | O | 224-225°C |
| 137 | 3-CH ₃ | 2-F, 4-Cl | H | H | H | O | 117-118°C |
| 138 | 3-CH ₃ | 2-Cl, 4-F | H | H | H | O | 178-179°C |
| 139 | 4-萘甲基 | - | H | H | H | S | 155-156°C |
| 140 | 4-萘甲基 | 2-Cl, 3-Cl | H | H | H | S | 175-177°C |
| 141 | 3-CH ₃ | 2-F, 4-F, 5-F | H | H | H | S | 2.3 (s), 3.05 (mc), 3.25 (t), 3.8 (mc), 5.05 (mc), 6.85-7.15 (m) |
| 142 | 2-CH ₃ , 4-CH ₃ | 2-Cl, 3-Cl | H | H | H | S | 2.2 (2 x s), 2.6-2.8 (mc), 3.15 (t), 3.6 (mc), 5.2 (mc), 6.9-7.55 (m)* |
| 143 | 3-CH ₃ , 4-CH ₃ | - | H | H | H | S | 2.2 (2 x s), 3.0 (mc), 3.2 (mc), 3.85 (mc), 4.9 (mc), 6.75-7.35 (m) |
| 144 | 3-CH ₃ | 3-Br, 5-Br | H | H | H | O | 128-130°C |

| 實例 | (R ¹) _n | (R ²) _m | R ^{5a} | R ^{5c} | R ^{5d} | X | 物理化學數據 (熔點[°C]; ¹ H-NMR (CDCl ₃): δ [ppm]; HPLC-MS: RT[分鐘], 分子質量 |
|-----|--------------------------------|----------------------------------|-----------------|-----------------|-----------------|---|---|
| 145 | 3-CH ₃ | 2-Cl, 5-Cl | H | H | H | O | 189-191°C |
| 146 | 3-CH ₃ | 2-Cl, 5-Cl | H | H | H | S | 125-127°C |
| 147 | 3-CH ₃ | 3-Br, 5-Br | H | H | H | S | 127-130°C |
| 148 | 3-CH ₃ | 2-Cl, 3-Cl, 4-CH ₃ | H | H | H | S | 205-208°C |
| 149 | 3-CH ₃ | 2-F, 3-F, 6-F | H | H | H | S | 2.25 (s), 3.05 (mc), 3.25 (t), 3.9 (t), 5.45 (mc), 6.85-7.1 (m) |
| 150 | 3-CH ₃ | 2-F, 3-F, 5-F | H | H | H | S | 2.3 (s), 3.0 (mc), 3.25 (t), 3.85 (mc), 5.15 (mc) 6.7-7.15 (m) |
| 151 | 3-CH ₃ | 2-F, 6-F, 3-Cl | H | H | H | S | 3.315 367[M+H] ⁺ |
| 152 | 3-CH ₃ | 2-Br | H | H | H | S | 2.35 (s), 3.05 (mc), 3.25 (mc), 3.8 (mc), 4.9 (mc), 7.05-7.65 (m) |
| 153 | 3-CH ₃ | 3-Br | H | H | H | S | 2.913 377[M+H] ⁺ |
| 154 | 3-CH ₃ | 4-Br | H | H | H | S | 135-136°C |
| 155 | 3-CH ₃ | 2-F, 6-Cl | H | H | H | S | 96-97°C |
| 156 | 3-CH ₃ | 2-Cl, 4-Cl | H | H | H | S | 2.35 (s), 3.0 (mc), 3.25 (mc), 3.85 (mc), 5.0 (mc), 7.05-7.5 (m) |
| 157 | 3-CH ₃ | 3-Cl, 4-Cl | H | H | H | S | 2.3 (s), 3.0 (mc), 3.25 (t), 3.85 (mc), 4.85 (t), 6.8-7.35 (m) |
| 158 | 3-CH ₃ | 3-F, 5-F | H | H | H | S | 2.25 (s), 3.0 (mc), 3.2 (mc), 3.85 (mc), 4.85 (mc), 6.65-7.15 (m) |
| 159 | 3-CH ₃ | 2-Cl, 3-Cl | H | H | H | O | 165-167°C |
| 160 | 3-CH ₃ | 3-Cl, 4-Cl | H | H | H | O | 127-130°C |
| 161 | 3-CH ₃ | 2-F, 6-Cl | H | H | H | O | 109-111°C |

| 實例 | (R ¹) _n | (R ²) _m | R ^{5a} | R ^{5c} | R ^{5d} | X | 物理化學數據 (熔點 [°C]; ¹ H-NMR (CDCl ₃): δ [ppm]; HPLC-MS: RT [分鐘], 分子質量 |
|-----|---|--------------------------------|-----------------|-----------------|-----------------|---|---|
| 162 | 3-CH ₃ | 3-F, 5-F | H | H | H | O | 146-148°C |
| 163 | 4-CH ₃ | 2-Cl, 3-Cl | H | H | H | S | 168-169°C |
| 164 | 3-CH ₃ | 2-F, 5-Br | H | H | H | S | 3.119 393[M+H] ⁺ |
| 165 | - | 3,4-(亞甲基二 氧基)苯基 | H | H | H | S | 120-122°C |
| 166 | 3-($-O-CH_2-O-$), 4-($-O-CH_2-O-$) | - | H | H | H | S | 2,638 326 [M+H] ⁺ |
| 167 | - | 3-甲氧基-萘-乙 -基 | H | H | H | S | 362 [M+H] ⁺ |

實例 45：[2-(3-氯苯基)-1-苯基乙基亞胺基]-噻唑啉-3-羧酸甲酯

1-[2-(3-氯苯基)-2-苯基-乙基]-(4,5-二氫噻唑-2-基)-胺 (0.50克)，碳酸鉀(0.33克)，二甲基甲醯胺(10毫升)，及2-3滴三乙胺之混合物在室溫以氯甲酸甲酯(0.18克)處理，攪拌過夜。以水稀釋，萃取入第三丁基甲基醚中，獲得粗產物，其在矽石上管柱層析純化，獲得[2-(3-氯苯基)-1-苯基乙基亞胺基]-噻唑啉-3-羧酸甲酯(0.25克)。

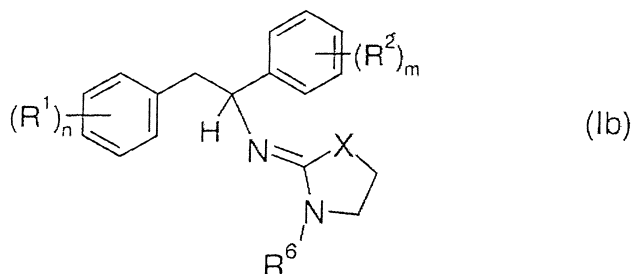
實例 46：[2-(3-氯苯基)-1-苯基乙基亞胺基]-噻唑啉-3-腈

1-[1-(4-氯苯基)-2-苯基-乙基]-(4,5-二氫噻唑-2-基)-胺 (0.50克)，碳酸鉀(0.33克)，二甲基甲醯胺(10毫升)，及2-3滴三乙胺之混合物在室溫以溴化氰處理，攪拌過夜，然後在50°C攪拌3小時。水加入，反應混合物以甲基第三丁基醚萃取。在乾燥後，溶劑蒸發，殘餘物在矽膠上進行層析，

獲得19%睛。

通式Ib之化合物(實例47至49)以此製備。這些化合物之光譜數據列於表2。

表2：



| 實例 | (R ¹) _m | (R ²) _n | R ^b | X | 物理化學數據 (熔點 [°C]; ¹ H-NMR (CDCl ₃): δ [ppm]; HPLC-MS: RT[分鐘], 分子質量 |
|-----|--------------------------------|--------------------------------|-------------------------------|---|--|
| 45 | 3-Cl | - | C(O)OCH ₃ | S | 2.95-3.2 (m), 3.9 (s), 4.0 (mc), 4.25 (mc), 6.95-7.35 (m) |
| 46 | 3-Cl | - | CN | S | 3.05 (mc), 3.20 (mc), 3.80 (mc), 4.15 (mc), 7.0-7.4 (m) |
| 47 | - | - | C ₂ H ₅ | S | 1.0 (mc), 2.9-3.5 (m), 4.1 (mc), 7.0-7.3 (m) |
| 48 | 3-Cl | - | C ₂ H ₅ | S | 1.15 (t), 3.0 (mc), 3.3-3.6 (m), 4.15 (mc), 6.9-7.4 (m) |
| 49 | 3-F | - | CH ₃ | O | 2.80 (s), 2.95 (d), 3.2 (mc), 3.9-4.1 (m), 4.75 (mc), 6.75-7.35 (m) |
| 168 | 3-Cl | - | COOCH ₃ | O | 358 [M+H] ⁺ |

棉蚜 (*Aphis gossypii*)

子葉期之棉花植物(品種'Delta Pine')以約100隻實驗室飼養之蚜蟲侵襲，以受侵襲之葉切片放於試驗植物之頂部。在24小時後移除葉切片。完整植物之子葉浸入試驗化合物之濃度梯度溶液中。在5天後，測定試驗植物上蚜蟲死亡率，相對於檢驗植物之死亡率。

在此試驗中，300 ppm實例14，18，19，24，25，26，29，

35, 36, 41, 42, 43及45, 51, 52, 53, 61, 64, 70, 79, 82, 83, 100, 101, 114, 118, 123, 124, 131, 132, 133, 134, 135, 142, 144, 147, 150, 155, 159, 162及163化合物, 與未處理之對照比較, 顯示大於80%之死亡率。

桃蚜 (*Myzus persicae*)

第二對葉期胡椒植物(品種'California Wonder')以約40隻實驗室飼養之蚜蟲侵襲, 以受侵襲之葉切片放於試驗植物之頂部。在24小時後移除葉切片。完整植物之葉浸入試驗化合物之濃度梯度溶液中。在5天後, 測定試驗植物上蚜蟲死亡率, 相對於檢驗植物之死亡率。

在此試驗中, 300 ppm實例5, 6, 7, 14, 15, 16, 18, 19, 23, 24, 25, 26, 27, 29, 30, 33, 34, 35, 36, 38, 41, 42, 43, 44, 45, 46及49, 51, 52, 54, 56, 63, 70, 71, 76, 78, 81, 83, 91, 98, 99, 101, 102, 103, 108, 115, 119, 122, 125, 130, 132, 136, 137, 141, 144, 156, 157, 160, 161及164化合物, 與未處理之對照比較, 顯示大於80%之死亡率。

蠶豆蚜 (*Aphis fabae*)

第一對葉期之旱金蓮屬 (*Nasturtium*) 植物 (品種 'Mixed Jewel') 以約25隻實驗室飼養之蚜蟲侵襲, 以受侵襲之切割植物放於試驗植物之頂部。在24小時後移除切割植物。試驗植物之葉及莖浸入試驗化合物之濃度梯度溶液中。在3天後, 測定蚜蟲死亡率。

在此試驗中, 300 ppm實例6, 66, 93, 146及162化合物,

與未處理之對照比較，顯示大於80%之死亡率。

2. 對抗害蟲作用之實例

式I化合物對抗害蟲之作用以下列實驗證明：

調配活性化合物

- a. 成為50：50丙酮：水溶液加100 ppm Kinetic® (表面活性劑)，用於測試對抗棉蚜 (*Aphis gossypii*)，桃蚜 (*Myzus persicae*)，及蠶豆蚜 (*Aphis fabae*)之活性，
- b. 於35%丙酮及水混合物中成為10.000 ppm溶液，若需要，以水稀釋，用於測試對抗亞熱帶黏蟲 (*Sopodoptera eridania*)之活性，

在實驗完成後，在各情況中與未處理之對照比較，測定化合物造成75至100%抑制之最低濃度或死亡率(限制或最小濃度)。

棉蚜 (*Aphis gossypii*)

子葉期之棉花植物(品種'Delta Pine')以約100隻實驗室飼養之蚜蟲侵襲，以受侵襲之葉切片放於試驗植物之頂部。在24小時後移除葉切片。完整植物之子葉浸入試驗化合物之濃度梯度溶液中。在5天後，測定試驗植物上蚜蟲死亡率，相對於檢驗植物之死亡率。

在此試驗中，300 ppm實例14，18，19，24，25，26，29，35，36，41，42，43及45化合物，與未處理之對照比較，顯示大於80%之死亡率。

桃蚜 (*Myzus persicae*)

第二對葉期胡椒植物(品種'California Wonder')以約40隻

實驗室飼養之蚜蟲侵襲，以受侵襲之葉切片放於試驗植物之頂部。在24小時後移除葉切片。完整植物之葉浸入試驗化合物之濃度梯度溶液中。在5天後，測定試驗植物上蚜蟲死亡率，相對於檢驗植物之死亡率。

在此試驗中，300 ppm實例5，6，7，14，15，16，18，19，23，24，25，26，27，29，30，33，34，35，36，38，41，42，43，44，45，46及49化合物，與未處理之對照比較，顯示大於80%之死亡率。

蠶豆蚜(*Aphis fabae*)

第一對葉期之早金蓮屬(*Nasturtium*)植物(品種'Mixed Jewel')以約25隻實驗室飼養之蚜蟲侵襲，以受侵襲之切割植物放於試驗植物之頂部。在24小時後移除切割植物。試驗植物之葉及莖浸入試驗化合物之濃度梯度溶液中。在3天後，測定蚜蟲死亡率。

在此試驗中，300 ppm實例6化合物，與未處理之對照比較，顯示大於80%之死亡率。

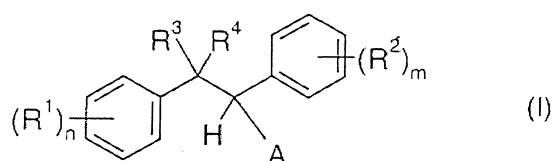
亞熱帶黏蟲(*Spodoptera eridania*)，第二齡幼蟲

一個3.8平方公分塑膠盆中之二株雪豆(*Sieva lima bean*)植物在第一個展開真葉期之葉浸入試驗溶液中，攪動3秒鐘，並在一個罩中乾燥。然後放入一個25.4公分頂部塑膠拉鏈之袋中，以10隻第二齡蠶(caterpillars)侵襲。在5天後，觀察死亡率，減少進食，或任何干擾正常蛻變。

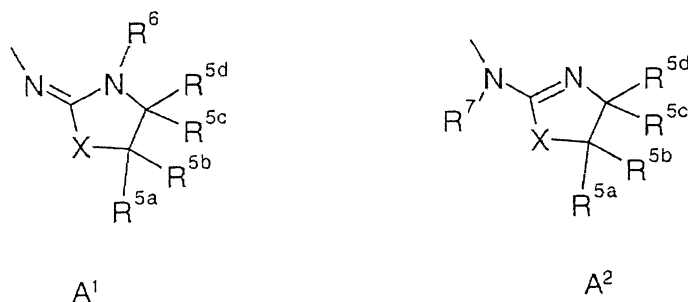
在此試驗中，300 ppm實例16化合物，與未處理之對照比較，顯示大於50%之死亡率。

五、中文發明摘要：

本發明係關於下通式 I 之 1-(吡咯啉 (azolin)-2-基) 胺基-1,2-二苯基乙烷化合物



其中 A 為下式 A¹ 或 A² 之基：



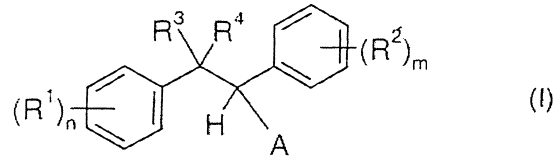
其中 m 為 0, 1, 2, 3, 4 或 5, n 為 0, 1, 2, 3, 4 或 5, X 為硫或氧，及其中各變數 R¹, R², R³, R⁴, R^{5a}, R^{5b}, R^{5c}, R^{5d} 如申請專利範圍中定義，及其農業上可接受鹽。

本發明亦關於一種對抗動物害蟲選自昆蟲，蜘蛛 (arachnids)，及線蟲之方法，及一種保護作物避免昆蟲，蜘蛛，或線蟲侵襲或侵害之方法，其包含使一種作物接觸除害有效量之一種通式 I 之 1-(吡咯啉-2-基) 胺基-1,2-二苯基乙烷化合物及 / 或至少一種其鹽。

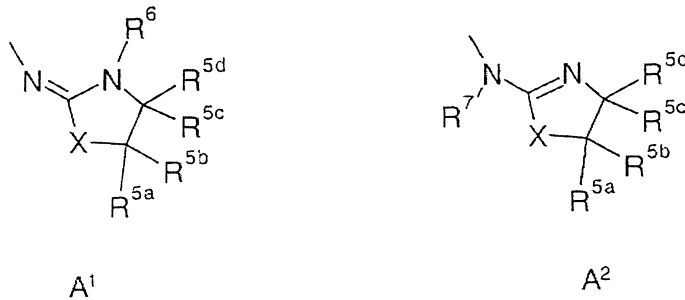
六、英文發明摘要：

十、申請專利範圍：

1. 一種通式(I)之1-(吡咯啉(azolin)-2-基)胺基-1,2-二苯基乙烷化合物，



其中A為下式A¹或A²之基：



其中

m為0，1，2，3，4或5；

n為0，1，2，3，4或5；

X為硫或氧；

R¹, R² 各獨立為鹵素，OH，SH，NH₂，SO₃H，COOH，
 氰基，硝基，C₁-C₆-烷基，C₁-C₆-烷氧基，C₁-C₆-
 烷胺基，二(C₁-C₆-烷基)胺基，C₁-C₈-烷硫基，
 C₂-C₆-烯基，C₂-C₆-烯基氧基，C₂-C₆-烯基胺基，
 C₂-C₆-烯基硫基，C₂-C₆-炔基，C₂-C₆-炔基氧基，
 C₂-C₆-炔基胺基，C₂-C₆-炔基硫基，C₁-C₆-烷基磺
 醯基，C₁-C₆-烷基硫氧基(sulfoxyl)，C₂-C₆-烯基
 磺醯基，C₂-C₆-炔基磺醯基，甲醯基，C₁-C₆-烷
 基羧基，C₂-C₆-烯基羧基，C₂-C₆-炔基羧基，C₁-C₆-

烷氧基羰基，C₂-C₆-烯基氧基羰基，C₂-C₆-炔基氧基羰基，羰基氧基，C₁-C₆-烷基羰基氧基，C₁-C₆-烯基羰基氧基，C₁-C₆-炔基羰基氧基，其中上述基之脂族基中碳原子可攜帶1，2或3個R[#]基之任何組合，

C(O)NR^aR^b，(SO₂)NR^aR^b，其中R^a及R^b各獨立為氫，C₁-C₆-烷基，C₂-C₆-烯基，或C₂-C₆-炔基，其中這些基中碳原子可攜帶1，2或3個R[#]基之任何組合，

Y-Ar基或Y-Cy基，其中

Y 為一個單鍵，氧，硫，C₁-C₆-烷二基，或C₁-C₆-烷二基氧基，

Ar 為苯基，萘基，或一個單環或雙環之5至10員雜芳環，其含有1，2，3或4個雜原子選自氧，硫，及氮作為環成員，其中Ar未經取代或可攜帶1，2，3，4或5個R[#]基之任何組合；
及

Cy 為C₃-C₁₂-環烷基，其未經取代或經1，2，3，4或5個R[#]基之任何組合取代；

其中結合於苯環之相鄰碳原子之二個R¹基或二個R²基可與該碳原子一起形成一個稠合苯環，一個稠合之飽和或部份未飽和之5，6或7員碳環，或一個稠合之5，6或7員雜環，其含有1，2，3或4個雜原子選自氧，硫，及氮作為環成員，其中

稠合環未經取代或可攜帶1, 2, 3或4個R[#]基之任何組合；

R³, R⁴ 各獨立為氫, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-鹵烷基, C₃-C₆-環烷基, 其中這些基中碳原子可攜帶1, 2或3個R[#]基之任何組合,

苯基或苯甲基, 各未經取代, 或經1至5個鹵素, 1至3個C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-鹵烷基, C₁-C₆-烷硫基, C₁-C₆-鹵烷硫基, C₁-C₆-烷氧基, 或C₁-C₆-鹵烷氧基之任何組合取代；

R^{5a}, R^{5b}, R^{5c}, R^{5d} 各獨立為氫, C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-鹵烷基, C₁-C₆-烷胺基, C₁-C₆-烷氧基, C₃-C₆-環烷基, 其中這些基中碳原子可攜帶1, 2或3個R[#]基, 鹵素, 氰基, 硝基, 羥基, 巰基, 胺基之任何組合, 苯基或苯甲基, 各未經取代, 或經1至5個鹵素, 1至3個C₁-C₆-烷基, C₁-C₆-鹵烷基, C₁-C₆-烷硫基, C₁-C₆-鹵烷硫基, C₁-C₆-烷氧基, 或C₁-C₆-鹵烷氧基之任何組合取代；

R⁶ 為氫, 氰基, 硝基, C₁-C₆-烷基, 甲醯基, C₁-C₆-烷基羰基, C₁-C₆-烷氧基羰基, C₁-C₆-烷硫基羰基, 其中上述基之脂族基中碳原子可攜帶1, 2或3個R[#]基之任何組合,

C(O)NR^aR^b, 或(SO₂)NR^aR^b, 其中R^a及R^b如上述定義, 苯基, 苯基氧基, 或苯甲基, 最後三個基各可未經取代, 或經1至5個鹵素, 1至3個C₁-C₆-

烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_1-C_6 -烷硫基， C_1-C_6 -鹵烷硫基， C_1-C_6 -烷氧基，或 C_1-C_6 -鹵烷氧基之任何組合取代；

R^7 為氫，氰基，硝基， C_1-C_6 -烷基，甲醯基， C_1-C_6 -烷基羰基， C_1-C_6 -烷氧基羰基，其中上述基之脂族基中碳原子可攜帶1，2或3個 $R^\#$ 基之任何組合， $C(O)NR^aR^b$ ，或 $(SO_2)NR^aR^b$ ，其中 R^a 及 R^b 如上述定義，苯基，苯基氧基，或苯甲基，最後三個基各可未經取代，或經1至5個鹵素，1至3個 C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_1-C_6 -烷硫基， C_1-C_6 -鹵烷硫基， C_1-C_6 -烷氧基，或 C_1-C_6 -鹵烷氧基之任何組合取代；

$R^\#$ 為鹵素，氰基，硝基，羥基，巰基，胺基，羧基， C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -烷氧基， C_2-C_6 -烯基氧基， C_2-C_6 -炔基氧基， C_1-C_6 -鹵烷氧基，或 C_1-C_6 -烷硫基；

及其農業上可接受鹽。

2. 如請求項1之化合物，其中 R^3 為氫或 C_1-C_4 -烷基。
3. 如請求項1或2之化合物，其中 R^4 為氫， C_1-C_4 -烷基， C_1-C_4 -鹵烷基， C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基，或苯基，其未經取代，或經1至5個鹵素，1至3個 C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_1-C_6 -烷硫基， C_1-C_6 -鹵烷硫基， C_1-C_6 -烷氧基，或 C_1-C_6 -鹵烷氧基之任何組合取代。
4. 如請求項1或2之化合物，其中 R^3 及 R^4 均為氫。

5. 如請求項1或2之化合物，其中 R^3 為氫， R^4 係選自 C_1-C_4 -烷基， C_1-C_4 -鹵烷基， C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基，或苯基，其未經取代，或經1至5個鹵素，1至3個 C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_1-C_6 -烷硫基， C_1-C_6 -鹵烷硫基， C_1-C_6 -烷氧基，或 C_1-C_6 -鹵烷氧基之任何組合取代。
6. 如請求項1或2之化合物，其中式I中A為 A^1 ，其中 R^6 為氫， C_1-C_4 -烷基，甲醯基， C_1-C_6 -烷基羰基， C_1-C_4 -鹵烷基羰基， C_1-C_6 -烷氧基羰基， C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷氧基羰基，或 C_1-C_6 -烷硫基羰基。
7. 如請求項1或2之化合物，其中式I中A為 A^2 ，其中 R^7 為氫。
8. 如請求項1或2之化合物，其中 R^{5a} ， R^{5b} ， R^{5c} 及 R^{5d} 各為氫。
9. 如請求項1或2之化合物，其中 R^{5a} ， R^{5b} ， R^{5c} 及 R^{5d} 中至少一個不為氫。
10. 如請求項1或2之化合物，其中式I中n為0，1或2。
11. 如請求項1或2之化合物，其中式I中m為0，1或2。
12. 如請求項10或11之化合物，其中n+m為整數1，2，3或4。
13. 如請求項1或2之化合物，其中 R^1 及 R^2 各獨立選自鹵素， C_1-C_4 -烷基， C_1-C_4 -烷氧基， C_1-C_4 -鹵烷基，及苯基，其未經取代，或經1至5個鹵素，1至3個 C_1-C_6 -烷基， C_1-C_6 -鹵烷基， C_1-C_6 -烷硫基， C_1-C_6 -鹵烷硫基， C_1-C_6 -烷氧基，或 C_1-C_6 -鹵烷氧基之任何組合取代。
14. 一種對抗動物害蟲選自昆蟲，蜘蛛(arachnids)，及線蟲之方法，其包含使該動物害蟲，其棲息處，繁殖地，食物供給，動物害蟲生長或可能生長之植物，種子，土壤，

區域，物質，或環境，或欲保護避免昆蟲，蜘蛛，或線蟲侵襲或侵害之物質，植物，種子，土壤，表面，或空間接觸除害有效量之至少一種如請求項1之通式I之1-(吡咯啉-2-基)胺基-1,2-二苯基乙烷化合物及/或至少一種其鹽。

15. 一種保護作物避免昆蟲，蜘蛛，或線蟲侵襲或侵害之方法，其包含使一種作物接觸除害有效量之至少一種如請求項1之通式I之1-(吡咯啉-2-基)胺基-1,2-二苯基乙烷化合物及/或至少一種其鹽。
16. 一種農業組合物，其包含至少一種如請求項1之通式I之1-(吡咯啉-2-基)胺基-1,2-二苯基乙烷化合物及/或至少一種其鹽及一種固體或液體載劑。

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：(無)

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

