



(21) 申請案號：103128057

(22) 申請日：中華民國 103 (2014) 年 08 月 15 日

(51) Int. Cl. :

*A01N43/56 (2006.01)**A01N43/78 (2006.01)**C07D401/04 (2006.01)**C07D401/14 (2006.01)**C07D403/04 (2006.01)**C07D405/14 (2006.01)**C07D407/14 (2006.01)**C07D409/14 (2006.01)**C07D413/04 (2006.01)**C07D417/04 (2006.01)**C07D417/14 (2006.01)**C07D471/04 (2006.01)**C07D513/04 (2006.01)*

(30) 優先權：2013/09/13

美國

61/877,329

(71) 申請人：杜邦股份有限公司 (美國) E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY (US)

美國

(72) 發明人：克拉克 大衛 CLARK, DAVID (US)；弗瑞加 布瑞納 葛洛里納 FRAGA,

BREENA GLORIANA (US)；張溫明 ZHANG, WENMING (CN)

(74) 代理人：陳傳岳；郭雨嵐

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：16 項 圖式數：0 共 279 頁

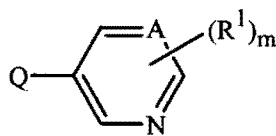
(54) 名稱

雜環取代之雙環唑殺蟲劑

HETEROCYCLE-SUBSTITUTED BICYCLIC AZOLE PESTICIDES

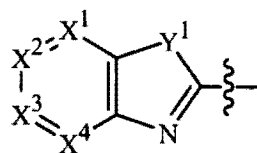
(57) 摘要

本揭露者為式 1 之化合物，包括所有其幾何及立體異構物、N-氧化物及鹽類，

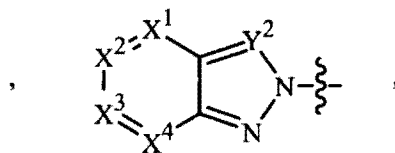


1

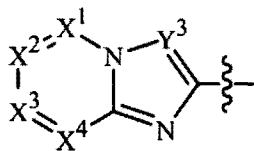
其中 Q 為



Q-1

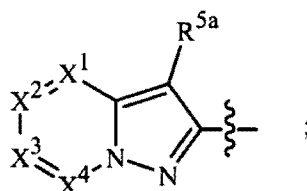


Q-2



Q-3

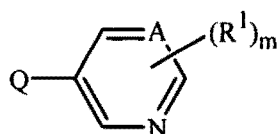
或



Q-4

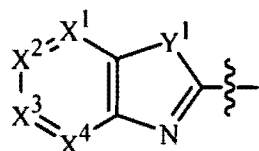
並且 A、R<sup>1</sup>、m、X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup>、X<sup>4</sup>、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup> 及 Y<sup>3</sup> 係如本揭露中所定義者。亦揭示者為含有式 1 化合物的組成物，以及用於防治無脊椎動物害蟲的方法，其包含使該無脊椎動物害蟲或其環境接觸一生物有效量之本發明化合物或組成物。

Disclosed are compounds of Formula 1, including all geometric and stereoisomers, N-oxides, and salts thereof,

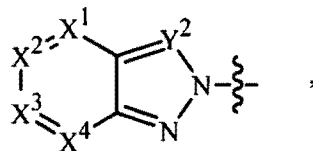


1

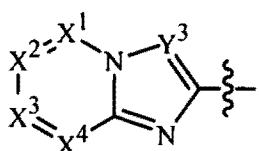
wherein Q is



Q-1

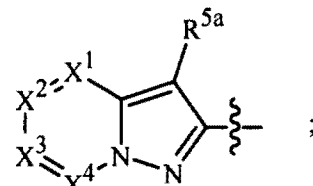


Q-2



Q-3

or



Q-4

and A, R<sup>1</sup>, m, X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, Y<sup>1</sup>, Y<sup>2</sup> and Y<sup>3</sup> are as defined in the disclosure. Also disclosed are compositions containing the compounds of Formula 1 and methods for controlling an invertebrate pest comprising contacting the invertebrate pest or its environment with a biologically effective amount of a compound or a composition of the invention.

201601631

## 發明摘要

※ 申請案號：103128057

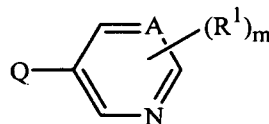
※ 申請日：103. 8. 15. ※ IPC 分類：A01N 43/56, 47/78 (2006.01)  
 C07D 401/64, 401/14, 403/64, 405/14, 407/14, 409/14 (2006.01)  
 C07D 413/64, 417/64, 417/14, 417/64, 513/64 (2006.01)

【發明名稱】 雜環取代之雙環唑殺蟲劑

HETEROCYCLE-SUBSTITUTED BICYCLIC AZOLE  
 PESTICIDES

【中文】

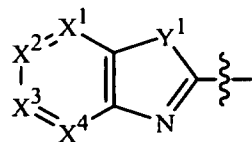
本揭露者為式 1 之化合物，包括所有其幾何及立體異構物、N-氧化物及鹽類，



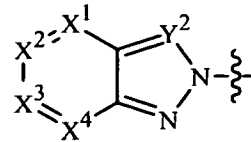
1

其中

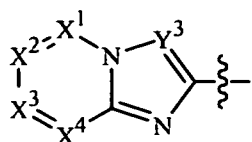
Q 為



Q-1

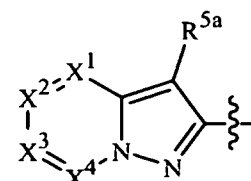


Q-2



Q-3

或

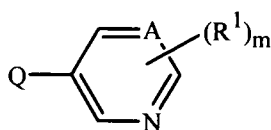


Q-4

並且 A、R<sup>1</sup>、m、X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup>、X<sup>4</sup>、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup> 及 Y<sup>3</sup> 係如本揭露中所定義者。亦揭示者為含有式 1 化合物的組成物，以及用於防治無脊椎動物害蟲的方法，其包含使該無脊椎動物害蟲或其環境接觸一生物有效量之本發明化合物或組成物。

**【英文】**

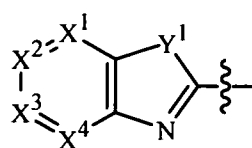
Disclosed are compounds of Formula 1, including all geometric and stereoisomers, *N*-oxides, and salts thereof,



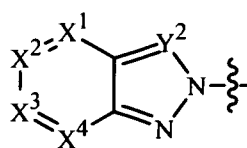
1

wherein

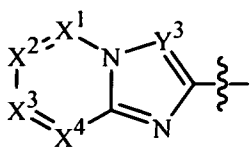
Q is



Q-1

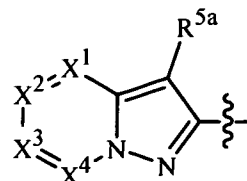


Q-2



Q-3

or



Q-4

and A, R<sup>1</sup>, m, X<sup>1</sup>, X<sup>2</sup>, X<sup>3</sup>, X<sup>4</sup>, Y<sup>1</sup>, Y<sup>2</sup> and Y<sup>3</sup> are as defined in the disclosure. Also disclosed are compositions containing the



.. compounds of Formula 1 and methods for controlling an invertebrate  
.. pest comprising contacting the invertebrate pest or its environment  
with a biologically effective amount of a compound or a composition  
of the invention.

**【代表圖】**

**【本案指定代表圖】**：無。

**【本代表圖之符號簡單說明】**：

**【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】**：

無

# 發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

**【發明名稱】** 雜環取代之雙環唑殺蟲劑

HETEROCYCLE-SUBSTITUTED BICYCLIC AZOLE  
PESTICIDES

**【技術領域】**

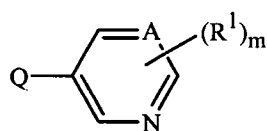
**【0001】** 本發明關於某些適用於農藝及非農藝用途之經取代雙環唑類、其 *N*-氧化物、鹽及組成物，以及彼等用於在農藝及非農藝環境中防治無脊椎動物害蟲如節肢動物之方法。

**【先前技術】**

**【0002】** 無脊椎動物害蟲之防治對於達成高農作物生產效率係極為重要的。無脊椎動物害蟲對於生長與儲存之農作物的危害，可引起產量的顯著下降且因而導致消費者成本增加。在森林、溫室農作物、觀賞植物、苗圃作物、儲藏食物及纖維產品、牲畜、家庭、草坪、木產品及公共與動物衛生中，無脊椎動物害蟲之防治亦為重要。現今有許多針對此目的之市售產品，但仍持續有對於更有效、成本較少、毒性較低、對環境較為安全或具有不同作用位點之新穎化合物的需求。

**【發明內容】**

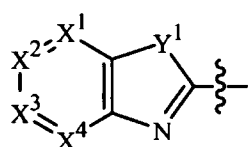
本發明係關於式 **1** 化合物（包括所有幾何及立體異構物）、其 *N*-氧化物及鹽，以及含有彼等之組成物與彼等用於防治無脊椎動物害蟲之用途：



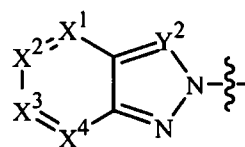
1

其中

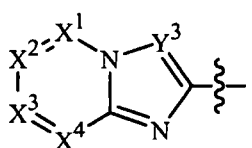
Q 為



Q-1

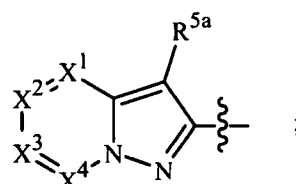


Q-2



Q-3

或



Q-4

A 為 CH、CR<sup>1</sup> 或 N；

各 R<sup>1</sup> 獨立為鹵素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷硫基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷硫基；

m 為 0、1、2 或 3；

X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup> 及 X<sup>4</sup> 各獨立為 CR<sup>2</sup>、CR<sup>3</sup> 或 N，前提是(i) X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup> 及 X<sup>4</sup> 其中一者為 CR<sup>2</sup>，且(ii) X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup> 及 X<sup>4</sup> 中不超過一者為 N；

R<sup>2</sup> 為 C(=Z)NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、N(R<sup>8</sup>)C(=Z)R<sup>9</sup>、C(=NR<sup>10</sup>)R<sup>11</sup> 或 Q<sup>a</sup>；

各 Z 獨立為 O 或 S；

各 R<sup>3</sup> 獨立為 H、鹵素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷氧基；

$Y^1$  為 O、S 或  $NR^4$ ；

$Y^2$  為 N 或  $CR^{5a}$ ；

$Y^3$  為 N 或  $CR^{5b}$ ；

$R^4$  為 H 或  $C_1-C_4$  烷基；

$R^{5a}$  為 H、鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基或  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

$R^{5b}$  為 H、鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基或  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

$R^6$  為 H、 $NR^{15}R^{16}$ 、 $OR^{17}$ 、 $C(=NR^{10})R^{11}$ 、 $C(O)OR^{21}$ 、 $C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $C(O)R^{22}$ 、 $S(O)_nR^{23}$  或  $Q^b$ ；或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_2-C_6$  烯基或  $C_2-C_6$  炔基，各為未經取代或經至少一個  $R^x$  取代；

$R^7$  為 H 或  $Q^b$ ；或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_2-C_6$  烯基或  $C_2-C_6$  炔基，各為未經取代或經至少一個  $R^x$  取代；或

$R^6$  及  $R^7$  係與它們所接附之氮原子一併考量而形成一 3 至 10 員環，該環含有選自碳原子與至多 2 個雜原子之環員，該至多 2 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 2 個氮原子，其中至多 2 個碳原子環員係獨立選自  $C(=O)$  與  $C(=S)$  且該硫原子環員係選自 S、 $S(O)$  或  $S(O)_2$ ，該環為未經取代或經至多 4 個  $R^x$  取代；或

$R^6$  及  $R^7$  係一併考量而為  $=S(O)_pR^{18}R^{19}$  或  $=S(=NR^{20})R^{18}R^{19}$ ；

各  $R^x$  獨立為鹵素、氰基、硝基、羥基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  鹵烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  鹵烷氧基、 $C_3-C_6$  環烷氧基、

$C(=NR^{10})R^{11}$ 、 $C(O)OR^{21}$ 、 $C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $OC(O)R^{22}$ 、 $NR^{25}R^{26}$ 、  
 $NR^{24}C(O)R^{22}$ 、 $C(O)R^{22}$ 、 $S(O)_nR^{23}$ 、 $Si(R^{28})_3$ 、 $OSi(R^{28})_3$  或  $Q^b$ ；

$R^8$  為  $H$ 、 $C(O)OR^{21}$ 、 $C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $C(O)R^{22}$ 、 $S(O)_nR^{23}$  或  $Q^b$ ；或  
 $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_2-C_6$  烯基或  $C_2-C_6$  炔基，各為未經  
 取代或經至少一個  $R^x$  取代；

$R^9$  為  $H$ 、 $C(=NR^{10})R^{11}$ 、 $OR^{21}$  或  $NR^{15}R^{16}$ ；或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷  
 基、 $C_2-C_6$  烯基或  $C_2-C_6$  炔基，各為未經取代或經至少一個  $R^x$  取  
 代；或苯基、苯氧基或一 5 或 6 員雜環芳環，各為未經取代或經至  
 少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、  
 硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  
 $C_1-C_4$  鹵烷氧基；或一 3 至 6 員雜環非芳環，各環含有選自碳原子  
 與至多 3 個雜原子之環員，該至多 3 個雜原子係獨立選自一個氧原  
 子、一個硫原子與至多 2 個氮原子，其中至多 1 個碳原子環員係獨  
 立選自  $C(=O)$  與  $C(=S)$  且該硫原子環員係選自  $S$ 、 $S(O)$  或  $S(O)_2$ ，  
 各環為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代  
 基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$   
 鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{10}$  獨立為  $OR^{12}$ 、 $S(O)_nR^{13}$  或  $NHR^{14}$ ；

各  $R^{11}$  獨立為  $H$ ；或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_2-C_6$  烯基或  $C_2-C_6$   
 炔基，各為未經取代或經至少一個  $R^x$  取代；或  $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-$   
 $C_6$  鹵烷氧基、 $C_3-C_6$  環烷氧基、 $C(O)OR^{21}$ 、 $C(O)NR^{15}R^{16}$ 、  
 $NR^{25}R^{26}$ 、 $NR^{24}C(O)R^{22}$ 、 $C(O)R^{22}$  或  $Q^b$ ；

各  $R^{12}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C(O)R^{22}$ 、 $S(O)_nR^{13}$  或  $Q^b$ ；

各  $R^{13}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基或  $C_1-C_4$  鹵烷基；

$R^{14}$  為  $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C(O)R^{22}$  或  $C(O)OR^{21}$ ；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{15}$  獨立為  $H$ 、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C(O)R^{27}$  或  $S(O)_2R^{27}$ ；或苯基或一 5 或 6 員雜環芳環，各為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{16}$  獨立為  $H$ 、 $C_1-C_6$  烷基或  $C_1-C_4$  鹵烷基；或

$R^{15}$  及  $R^{16}$  係與它們所接附之氮原子一併考量而形成一 3 至 7 員環，該環含有選自碳原子與至多 2 個雜原子之環員，該至多 2 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 2 個氮原子，其中至多 2 個碳原子環員係獨立選自  $C(=O)$  與  $C(=S)$  且該硫原子環員係選自  $S$ 、 $S(O)$  或  $S(O)_2$ ，該環為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

$R^{17}$  為  $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基或  $C_1-C_4$  鹵烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵

素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{18}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基或  $C_1-C_4$  鹵烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{19}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基或  $C_1-C_4$  鹵烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；或

$R^{18}$  及  $R^{19}$  係與它們所接附之硫原子一併考量而形成一環；

$R^{20}$  為 H、氰基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基或  $C(O)R^{22}$ ；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{21}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_3-C_6$  環烷基或  $C_3-C_6$  鹵環烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{22}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_3-C_6$  環烷基或  $C_3-C_6$  鹵環烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成



之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{23}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_3-C_6$  鹵環烷基、 $C_3-C_6$  環烷烷基或  $C_3-C_6$  鹵環烷烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{24}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基；

各  $R^{25}$  獨立為 H、 $C_1-C_4$  烷基或  $C_1-C_4$  鹵烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{26}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基或  $C_1-C_4$  鹵烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；或

$R^{25}$  及  $R^{26}$  係獨立與它們所接附之氮原子一併考量而形成一 3 至 7 員環，該環含有選自碳原子與至多 2 個雜原子之環員，該至多 2 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 2 個氮原子，其中至多 2 個碳原子環員係獨立選自  $C(=O)$  與  $C(=S)$  且該硫原子環員係選自  $S$ 、 $S(O)$  或  $S(O)_2$ ，該環為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷

基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基及 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷氧基；

各 R<sup>27</sup> 獨立為 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 鹵烷氧基或 NR<sup>29</sup>R<sup>30</sup>；或苯基或一 5 或 6 員雜環芳環，各為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基及 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷氧基；

各 R<sup>28</sup> 獨立為 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基或苯基；

各 R<sup>29</sup> 獨立為 H 或 Q<sup>b</sup>；或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基或 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基；各為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基及 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷氧基；

各 R<sup>30</sup> 獨立為 H 或 Q<sup>b</sup>；或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基或 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基；各為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基及 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷氧基；或

R<sup>29</sup> 及 R<sup>30</sup> 係與它們所接附之氮原子一併考量而形成一 3 至 10 員環，該環含有選自碳原子與至多 2 個雜原子之環員，該至多 2 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 2 個氮原子，其中至多 2 個碳原子環員係獨立選自 C(=O)與 C(=S)且該硫原子環員係選自 S、S(O)或 S(O)<sub>2</sub>，該環為未經取代或經至多 4 個獨立選自由下列

所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

$Q^a$  為一 5 至 10 員芳環或環系，各環或環系含有選自碳原子與至多 3 個雜原子之環員，該至多 3 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 3 個氮原子，其中至多 2 個碳原子環員係獨立選自  $C(=O)$  與  $C(=S)$  且該硫原子環員係選自  $S$ 、 $S(O)$  或  $S(O)_2$ ，各環或環系為未經取代或經至少一個  $R^x$  取代；或一 3 至 6 員部分飽和環，各環含有選自碳原子與至多 2 個雜原子之環員，該至多 2 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 2 個氮原子，其中至多 2 個碳原子環員係獨立選自  $C(=O)$  與  $C(=S)$  且該硫原子環員係選自  $S$ 、 $S(O)$  或  $S(O)_2$ ，各環為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $Q^b$  獨立為苯基、一 5 或 6 員雜環芳環或一 3 至 6 員雜環非芳環，各環含有選自碳原子與至多 2 個雜原子之環員，該至多 2 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 2 個氮原子，其中至多 2 個碳原子環員係獨立選自  $C(=O)$  與  $C(=S)$  且該硫原子環員係選自  $S$ 、 $S(O)$  或  $S(O)_2$ ，各環為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $n$  獨立為 0、1 或 2；以及

$p$  為 1 或 2。

**【0003】** 本發明亦提供一種組成物，其包含一式 **1** 化合物、其一 *N*-氧化物或一鹽，以及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑與液體稀釋劑所組成之群組的額外組分。在一實施例中，本發明亦提供一種用於防治無脊椎動物害蟲之組成物，其包含一式 **1** 化合物、其一 *N*-氧化物或一鹽，以及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑與液體稀釋劑所組成之群組的額外組分，該組成物可選擇地進一步包含至少一種額外生物活性化合物或藥劑。

**【0004】** 本發明進一步提供一種用於防治一無脊椎動物害蟲之噴霧組成物，其包含一式化合物 **1**、其一 *N*-氧化物或一鹽或者上述之組成物以及一推進劑。本發明亦提供一種用於防治一無脊椎害蟲之誘餌組成物，其包含一式化合物 **1**、其一 *N*-氧化物或一鹽或者以上實施例中所述之組成物、一或多種食物材料、可選擇地一引誘劑以及可選擇地一保濕劑。

**【0005】** 本發明進一步提供一種用於防治無脊椎動物害蟲之捕捉裝置，其包含該誘餌組成物及一適合收納該誘餌組成物之外殼，其中該外殼具有至少一開口，該開口之尺寸訂定為允許該無脊椎動物害蟲通過該開口，因此該無脊椎動物害蟲可自外殼外部之位置進入攝食該誘餌組成物，且其中該外殼進一步適合置放在無脊椎動物害蟲之潛在或已知活動地點或其附近。

**【0006】** 本發明提供一種用於防治一無脊椎動物害蟲之方法，其包含使該無脊椎動物害蟲或其環境與一生物有效量的一式 **1** 化合物、其一 *N*-氧化物或一鹽（例如，作為本文中所述之一組成物）接觸。本

發明亦涉及使該無脊椎動物害蟲或其環境與一組成物接觸之此類方法，該組成物包含一生物有效量的一式 1 化合物、其一 *N*-氧化物或一鹽，以及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑與液體稀釋劑所組成之群組的額外組分，該組成物可選擇地進一步包含一生物有效量的至少一種額外生物活性化合物或藥劑。

**【0007】** 本發明亦提供一種用於保護一種子免於一無脊椎動物害蟲之方法，其包含使該種子與一生物有效量的一式 1 化合物、其一 *N*-氧化物或一鹽（例如，作為本文中所述之一組成物）接觸。本發明亦關於該經處理之種子。本發明進一步提供一種用於保護一動物免於一無脊椎動物寄生性害蟲之方法，其包含對該動物投予一殺寄生蟲有效量的一式 1 化合物、其一 *N*-氧化物或一鹽（例如，作為本文中所述之一組成物）。本發明亦提供一式 1 化合物、其一 *N*-氧化物或一鹽（例如，作為本文中所述之一組成物）在保護一動物免於一無脊椎動物害蟲之用途。

**【0008】** 本發明亦提供一種增加一作物植物之活力的方法，其包含使該作物植物、長出該作物植物之種子或該作物植物之所在地（例如：生長介質）與一生物有效量之式 1 化合物（例如本文所述之組成物）接觸。

### **【實施方式】**

**【0009】** 如本文中所使用，術語「包含」、「包括」、「具有」、「含有」、「特徵在於」或其任何其他的變化，係意欲涵蓋非排他性的包含，並受到任何明確表示的限制。例如，包括元件列表的

組成物、混合物、製程或方法不必僅限於那些元件，而是可以包括未明確列出的或該組成物、混合物、製程或方法所固有的其他元件。

**【0010】** 連接詞「由...組成」則排除任何未明確說明的元件、步驟或成分。如果是在申請專利範圍中，這樣的用字將會封閉申請專利範圍，使其除了在通常會與其相關的雜質之外，不包括那些在列舉以外的物質。當該連接詞「由...組成」出現在申請專利範圍主體的子句，而非緊接著序言，其只限制在該子句中提到的元件；該項申請專利範圍之整體並不排除其他元件。

**【0011】** 連接詞「主要由...組成」用於定義包括除了那些字面上所揭露以外的材料、步驟、特徵、組分或元件的組成物或方法，但前提是該等額外的材料、步驟、特徵、組分或元件並不會實質影響申請專利範圍所主張發明的基本和新穎特性。用語「主要由...組成」居於「包含」與「由...組成」之間的中間地帶。

**【0012】** 若申請人以開放式用語如「包含」定義一發明或其部分，則表示（除非另有說明）該敘述應解讀為亦以「主要由...所組成」或「由...所組成」描述該發明。

**【0013】** 此外，除非另有明確地相反陳述，否則「或」係指包含性的「或」，而不是指排他性的「或」。例如，條件 A 或 B 可由以下任何一種情況滿足：A 為真（或存在的）且 B 為假（或不存在的）、A 為假（或不存在的）且 B 為真（或存在的），以及 A 和 B 均為真（或存在的）。

【0014】 同樣地，位於本發明之元件或組分之前的不定冠詞「一」及「一個」旨在非限制性地說明該元件或組分的出現數目（即出現次數）。因此「一」或「一個」應理解為包括一個或至少一個，且該元件或組分的單數詞形也包括複數，除非該數目顯然是指單數。

【0015】 當參照本揭露時，用語「無脊椎動物害蟲」包括在經濟上有重大危害之節肢動物、腹足動物、線蟲與蠕蟲。用語「節肢動物」包括昆蟲、蟎、蜘蛛、蠍、蜈蚣、馬陸、球潮蟲與千足蟲 (symphylans)。用語「腹足動物」包括蝸牛、蛞蝓與其他柄眼目。用語「線蟲」包括線形動物門之成員，像是植食性線蟲及寄生於動物的蠕蟲線蟲。用語「蠕蟲」包括所有的寄生蟲，像是蛔蟲（線形動物門）、心絲蟲（線形動物門胞管腎綱）、吸蟲（扁形動物門、吸蟲綱）、棘頭動物（棘頭動物門）與條蟲（扁形動物門條蟲綱）。

【0016】 在本揭露之內容中，「無脊椎動物害蟲之防治」意指抑制無脊椎動物害蟲之發育（包括死亡、攝食減少、與/或擾亂交配），並且相關描述具有類似的定義。

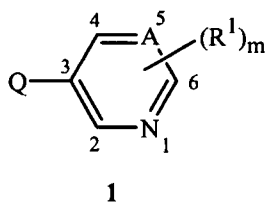
【0017】 用語「農藝」意指田間作物之生產，如食物與纖維，並包括玉米、大豆與其他豆科植物、稻米、穀類（如：小麥、燕麥、大麥、黑麥和米）、葉菜類（如：萵苣、甘藍菜及其他甘藍類作物）、果菜類（如：番茄、胡椒、茄子、十字花科植物及瓜類）、馬鈴薯、甘藷、葡萄、棉花、樹果類（如：梨果、硬核水果及柑橘）、小果實類（莓果和櫻桃）以及其他特別作物（如：油菜籽、向日葵及橄欖）的生長。

【0018】 用語「非農藝」意指其他非田間作物，像是園藝作物（例如溫室、苗圃或非生長於田地之裝飾性植物）、住宅的、農業的、商業的及工業的結構物、草皮地（如：草皮場、牧草地、高爾夫球場、草坪、運動場等）、木材製品、存積產物、農林及植被管理、公共衛生（即人）及動物健康（例如：家畜，如寵物、家畜及家禽，非家畜動物如野生動物）之應用。

【0019】 用語「作物活力」意指作物植物之生長或生物量累積速率。「作物活力增加」意指作物植物之生長或生物量累積增加（相對於未經處理之控制組之作物植物）。用語「作物生產力」意指在收穫作物植物後得到的作物材料的收成（量與質兩方面皆有）。「作物生產力增加」意指作物生產力增加（相對於未經處理之控制組之作物植物）。

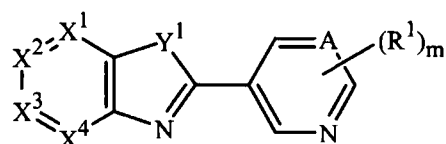
【0020】 用語「生物有效量」意指生物活性化合物（例如式 1 化合物）當施用於（即接觸）欲防治之無脊椎動物害蟲或其環境，或施用於植物、長出該植物之種子或該植物之所在地（例如生長介質）以保護該植物免受無脊椎動物害蟲的侵害或為了其他所欲功效（例如增加植物活力）時，足以產生所欲生物功效的量。

【0021】 變項  $R^1$  在式 1 結構中之位置係以下示之編號系統來描述。





【0022】 結構片段中之波狀線代表該片段連接至該分子其餘部分的接附點。例如，當式 1 中之變項 Q 係定義為 Q-1 時，等分 Q-1 中之鍵結的波狀線代表 Q-1 係在該位置處接附至式 1 結構之其餘部分，如下所示。



【0023】 在結構 Q-1、Q-2、Q-3 與 Q-4 中，變項  $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$  及  $X^4$  係定義為各獨立為  $CR^2$ 、 $CR^3$  或 N，前提是(i)  $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$  及  $X^4$  其中一者為  $CR^2$ ，並且(ii)  $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$  及  $X^4$  中不超過一者為 N。 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$  及  $X^4$  之此定義描述  $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$  及  $X^4$  的十六種可能組合，其示於下表中。

組合	$X^1$	$X^2$	$X^3$	$X^4$
1	$CR^2$	$CR^3$	$CR^3$	$CR^3$
2	$CR^2$	N	$CR^3$	$CR^3$
3	$CR^2$	$CR^3$	N	$CR^3$
4	$CR^2$	$CR^3$	$CR^3$	N
5	$CR^3$	$CR^2$	$CR^3$	$CR^3$
6	N	$CR^2$	$CR^3$	$CR^3$
7	$CR^3$	$CR^2$	N	$CR^3$
8	$CR^3$	$CR^2$	$CR^3$	N
9	$CR^3$	$CR^3$	$CR^2$	$CR^3$
10	N	$CR^3$	$CR^2$	$CR^3$
11	$CR^3$	N	$CR^2$	$CR^3$
12	$CR^3$	$CR^3$	$CR^2$	N
13	$CR^3$	$CR^3$	$CR^3$	$CR^2$
14	N	$CR^3$	$CR^3$	$CR^2$
15	$CR^3$	N	$CR^3$	$CR^2$
16	$CR^3$	$CR^3$	N	$CR^2$

**【0024】** 在上述說明中，用語「烷基」無論是單獨使用或在複合詞如「烷硫基」或「鹵烷基」中使用，皆包括直鏈或支鏈烷基，諸如甲基、乙基、正丙基、異丙基或不同之丁基、戊基或己基異構物。

「烯基」包括直鏈或支鏈烯類，如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基，以及各種的丁烯基、戊烯基及己烯基異構物。「烯基」也包括多烯類，如 1,2-丙二烯基及 2,4-己二烯基。「炔基」包括直鏈或支鏈炔類，如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、以及各種的丁炔基、戊炔基及己炔基異構物。「炔基」也包括由多個三鍵所構成之分子部分（moieties），如 2,5-己二炔基。

**【0025】** 「烷氧基」包括例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基與不同之丁氧基、戊氧基與己氧基異構物。「烷硫基」包括直鏈或支鏈烷硫基部分，像是甲硫基、乙硫基以及各種的丙硫基、丁硫基、戊硫基及己硫基異構物。

**【0026】** 「環烷基」包括例如環丙基、環丁基、環戊基和環己基。

**【0027】** 用語「鹵素」，無論是單獨使用或在如「鹵烷基」的複合詞中使用，或者在如「經鹵素取代之烷基」的敘述中使用時，包括氟、氯、溴或碘。此外，當在像是「鹵烷基」的複合詞中使用時，或者在像是「經鹵素取代之烷基」的敘述中使用時，所述烷基可能經相同或不同的鹵素原子部分或全部取代。「鹵烷基」或「經鹵素取代之烷基」的例子包括  $F_3C-$ 、 $ClCH_2-$ 、 $CF_3CH_2-$  及  $CF_3CCl_2-$ 。用語「鹵環烷基」、「鹵烷氧基」、「鹵烷硫基」、「鹵烯基」、「鹵炔基」與

類似者之定義皆類似於用語「鹵烷基」。「鹵烷氧基」的例子包括  $\text{CF}_3\text{O}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$  及  $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$ 。「鹵烷硫基」的例子包括  $\text{CCl}_3\text{S}-$ 、 $\text{CF}_3\text{S}-$ 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$  及  $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$ 。

**【0028】** 如本說明書中所用者，化學縮寫  $\text{S}(\text{O})$  與  $\text{S}(\text{=O})$  代表一亞磺醯基部分。如本文中所用者，化學縮寫  $\text{SO}_2$ 、 $\text{S}(\text{O})_2$  及  $\text{S}(\text{=O})_2$  代表一磺醯基分子部分。如本文中所用者，化學縮寫  $\text{C}(\text{O})$  及  $\text{C}(\text{=O})$  代表一羰基分子部分。如本文中所用者，化學縮寫  $\text{CO}_2$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{O}$  及  $\text{C}(\text{=O})\text{O}$  代表氧羰基分子部分。「 $\text{CHO}$ 」代表甲醯基。

**【0029】** 取代基中的碳原子總數係以字首「 $\text{C}_i\text{-C}_j$ 」來表示，其中  $i$  及  $j$  為 1 至 6 的數字。例如， $\text{C}_1\text{-C}_4$  烷磺醯基代表甲磺醯基至丁磺醯基； $\text{C}_2$  烷氧烷基代表  $\text{CH}_3\text{OCH}_2-$ ； $\text{C}_3$  烷氧烷基代表例如  $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)-$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2-$  或  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2-$ ；而  $\text{C}_4$  烷氧烷基代表一經一烷氧基基團（含總共四個碳原子）取代之烷基基團的各式異構物，例子包括  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2-$  及  $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2-$ 。

**【0030】** 當一化合物係經一取代基取代且該取代基帶有指示該等取代基之數目可超過 1 的下標時，該等取代基（當它們超過 1 時）係獨立選自所定義取代基之群組，例如  $(\text{R}^1)_m$ ， $m$  為 0、1、2 或 3。此外，當下標指示的是範圍，例如  $(\text{R})_{i-j}$ ，則取代基數目可選自介於  $i$  與  $j$  之間的整數（包括  $i$  與  $j$ ）。當一基團含有一可為氫之取代基（例如  $\text{R}^3$  或  $\text{R}^4$ ）時，則在將此取代基採用為氫時，可得知此等同於該基團係未經取代。當一可變基團係顯示為可選擇地接附至一位置（例如  $(\text{R}^1)_m$ ，其中  $m$  可為 0）時，則氫可在該位置處，即使未在該可變基團之定義

中敘述。當描述一基團上的一或多個位置為「未經取代」或「未取代」時，則氫原子係經接附以佔據任何自由價。

**【0031】** 除非另有指明，作為式 1 之組分的「環」或「環系」（例如，取代基  $Q^a$ ）為碳環或雜環。用語「環系」代表兩或更多個的稠環。用語「雙環系」與「稠合雙環系」代表由兩個稠環所組成的環系，其可為「鄰位稠合」、「橋接雙環」或「螺雙環」。「鄰位稠合雙環系」代表其兩個構成環共用兩個相鄰原子的環系。「橋接雙環系」係藉由將一具有一或多個原子之鏈段鍵結至一環之非相鄰環員而形成。「螺雙環系」係藉由將一具有兩或更多個原子之鏈段鍵結至一環之相同環員而形成。用語「稠合雜雙環系」表示至少一個環原子非為碳之稠合雙環系。用語「環員」意指形成環或環系之主鏈的原子或其他分子部分（例如  $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)$  或  $S(O)_2$ ）。

**【0032】** 用語「碳環」、「碳環化合物」或「碳環系」代表一環或環系，其中形成該環主鏈的原子僅選自碳。用語「雜環」或「雜環系」表示一環或環系，其中至少一個形成該環主鏈的原子非為碳，例如為氮、氧或硫。一般來說，雜環包含至多 4 個氮原子、至多 2 個氧原子以及至多 2 個硫原子。除非另有指明，碳環或雜環可為飽和或不飽和環。「飽和」係指主鏈係由彼此以單鍵鍵聯之原子所組成的環；除非另外指明，否則剩餘原子價係由氫原子所佔據。除非另有說明，「不飽和環」可為部分不飽和或完全不飽和。用語「完全不飽和環」意指環中原子之間的鍵結皆為單鍵或雙鍵（依據價鍵理論）的環，並且更進一步環中原子之間的鍵結在沒有疊雙鍵（即無  $C=C=C$  或

C=C=N) 的情況下包括儘可能多的雙鍵。用語「部分不飽和環」代表包含至少一個環員透過雙鍵鍵結至相鄰環員的環，並且理論上其在相鄰環員之間可能容納的非疊雙鍵數目（即在其完全不飽和之相對形式中）大於現有的雙鍵數目（在其部分不飽和形式中）。

**【0033】** 除非另有說明，雜環和環系可透過任何可用的碳或氮連接，藉由取代所述碳或氮上之氫。

**【0034】** 「芳香族化合物」意指每個環原子基本上在同一平面上並有一個  $p$  軌道垂直於環平面，且  $(4n + 2) \pi$  電子（其中  $n$  為正整數）與該環聯結以遵守休克耳定則。用語「芳環系」表示一個碳環系或雜環系，其中該環系的至少一個環為芳族。當一完全不飽和碳環滿足休克耳定則時，則該環亦稱為「芳環」或「芳碳環」。用語「芳碳環系」代表一個碳環系，其中該環系的至少一個環為芳族。當一完全不飽和雜環滿足休克耳定則時，則該環亦稱為「雜芳環」、「芳香族雜環」或「雜環芳環」。用語「芳香族雜環系」代表環系的至少一個環為芳香族之雜環系。用語「非芳環系」表示一個可能為完全飽和、部份或完全不飽和的碳環或雜環系，前提是環系中沒有環是芳族。用語「非芳碳環系」代表環系中沒有環為芳香族之碳環。用語「非芳雜環系」代表環系中沒有環為芳香族之雜環系。

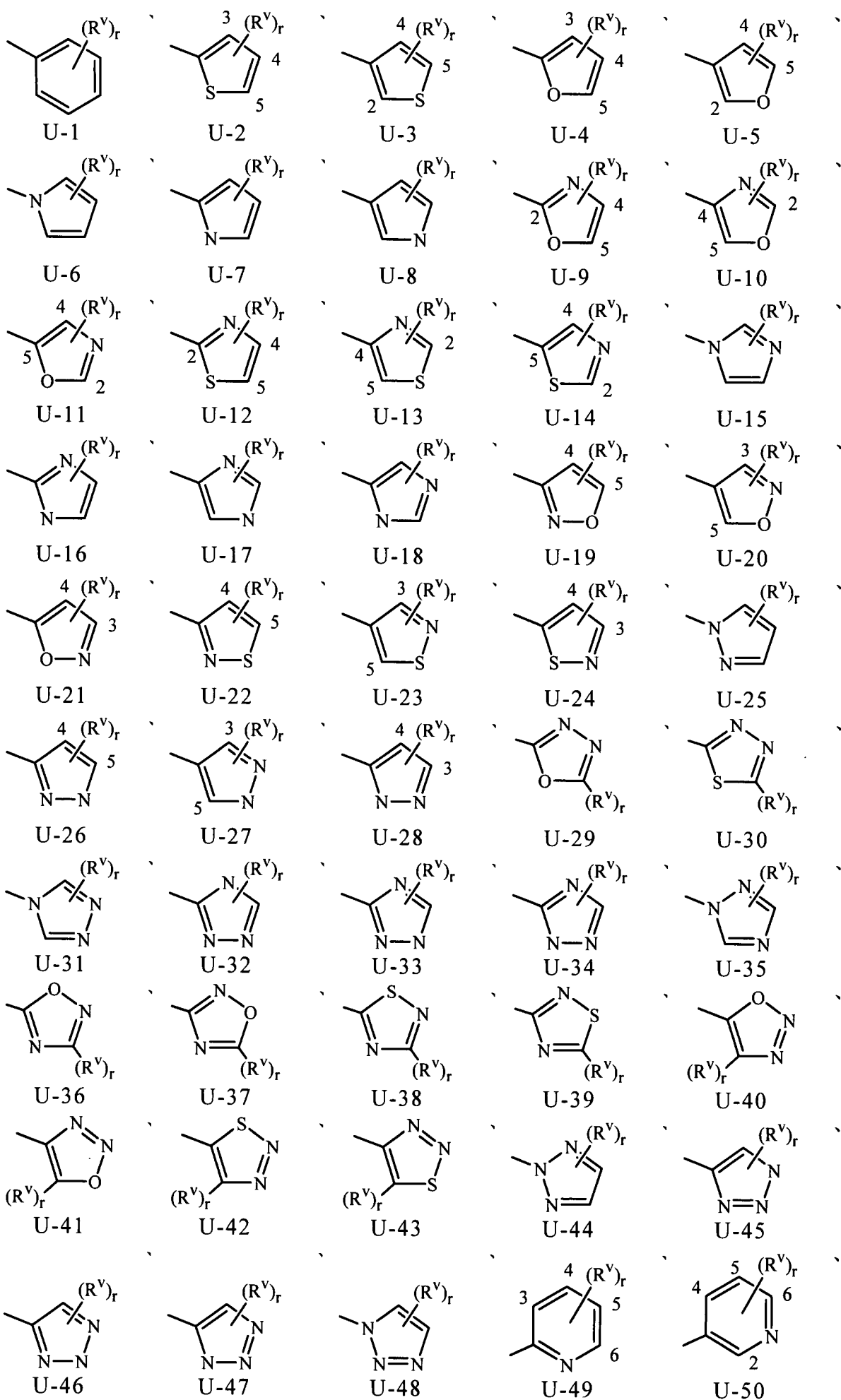
**【0035】** 用語「可選擇地經取代」與雜環連用時代表未經取代或具有至少一個非氫取代基，但不會使未經取代之類似物所具有之生物活性消失的基團。如本文中所使用，下列定義應適用於本文中，除非另有說明。用語「可選擇地經取代」可與片語「經取代或未經取代」

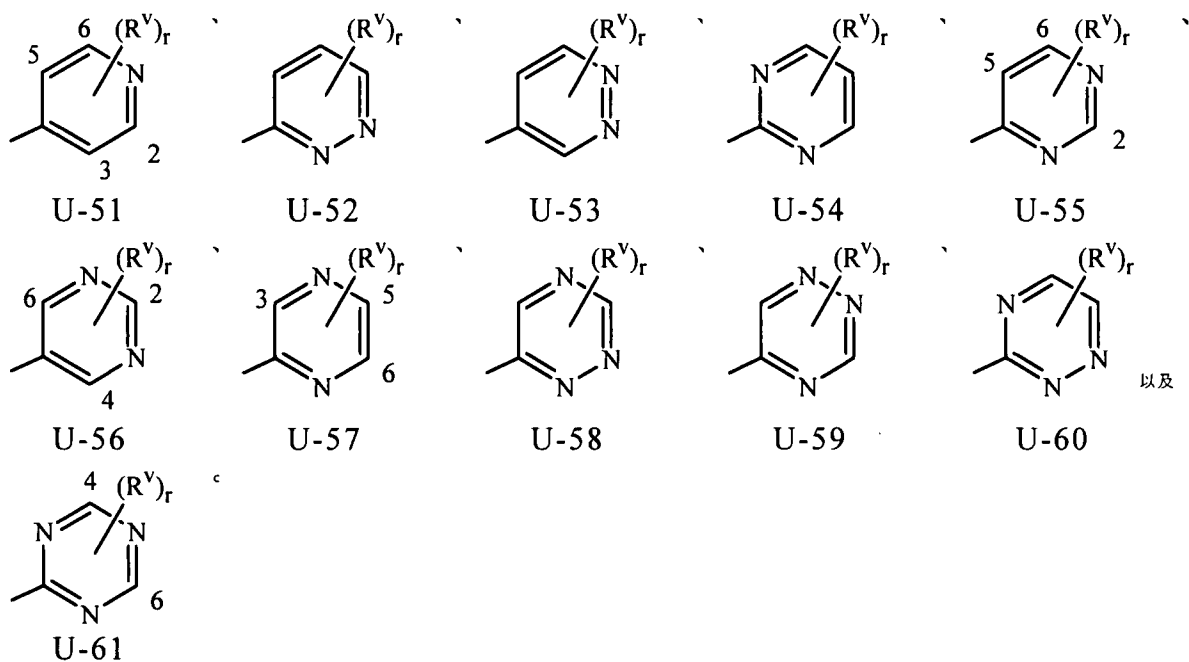
或用語「(未)經取代」交互使用。除非另有說明，一可選擇地經取代基團可在該基團的各個可取代位置具有一取代基，且各取代基係獨立於其他取代基。

**【0036】** 當取代基為 5 或 6 員含氮雜環時，其可透過任何可用之碳或氮環原子接附至式 1 的其餘部分，除非另有說明。如上所註明者， $Q^a$  可為（除了別的以外）可選擇地經一或多個取代基取代之苯基，該一或多個取代基係選自如發明內容中所定義之取代基群組。可選擇地經一至五個取代基取代之苯基的例子為如展示 1 中之 U-1 所繪示的環，其中  $R^v$  係如發明內容中針對  $Q^a$  所定義的  $R^x$ ，並且  $r$  為 0 至 5 的整數。

**【0037】** 如上所述， $Q^b$  可為（除了別的以外）可選擇地經一或多個取代基取代之 5 或 6 員雜環芳環，該一或多個取代基係選自如發明內容中所定義之取代基群組。可選擇地經一或多個取代基取代之 5 或 6 員不飽和芳香族雜環的例子包括展示 1 中所繪示之 U-2 至 U-61，其中  $R^v$  係發明內容中針對  $Q^b$  所定義之任何取代基，並且  $r$  為 0 至 4 的整數，此係受到各 U 基團上之可用位置數目所限制。由於 U-29、U-30、U-36、U-37、U-38、U-39、U-40、U-41、U-42 及 U-43 只有一個可用位置，這些 U 基團的  $r$  係限制為 0 或 1 的整數，並且  $r$  為 0 意指該 U 基團係未經取代且氮存在於由  $(R^v)_r$  所指示的位置上。

展示 1

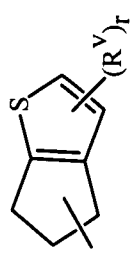




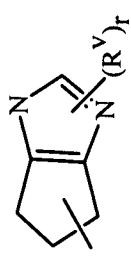
**【0038】** 如上所述， $Q^a$  可為（除了別的以外）可選擇地經一或多個取代基取代的 8、9 或 10 員鄰位稠合雙環系，該一或多個取代基係選自如發明內容中所定義之取代基群組。可選擇地經一或多個取代基取代的 8、9 或 10 員鄰位稠合雙環系的例子包括展示 3 中所繪示之環 U-81 至 U-123，其中  $R^v$  係如發明內容中針對  $Q^a$  所定義之任何取代基，並且  $r$  典型為 0 至 4 的整數。



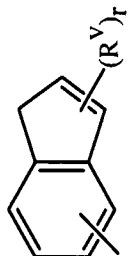
展示 3



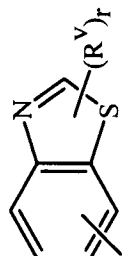
U-81



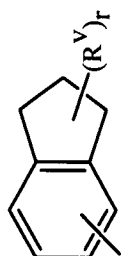
U-85



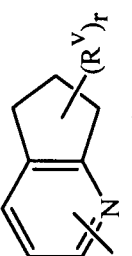
U-89



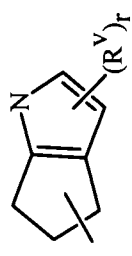
U-93



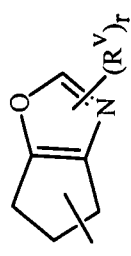
U-97



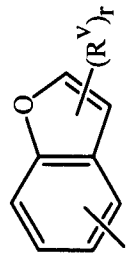
U-101



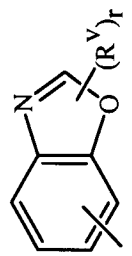
U-82



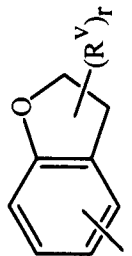
U-86



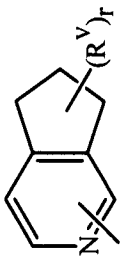
U-90



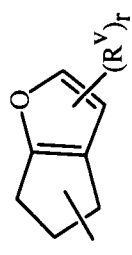
U-94



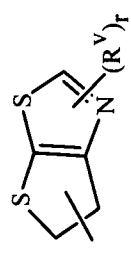
U-98



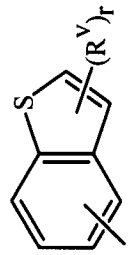
U-102



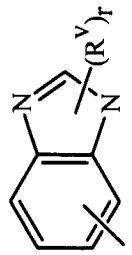
U-83



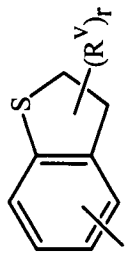
U-87



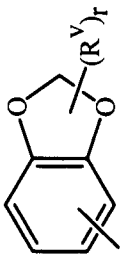
U-91



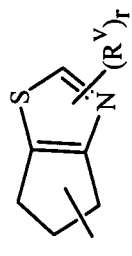
U-95



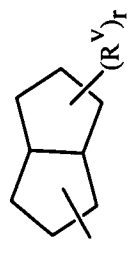
U-99



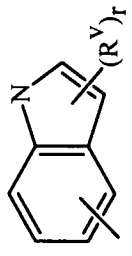
U-103



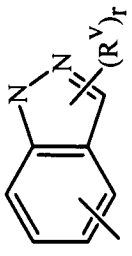
U-84



U-88



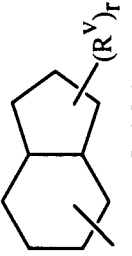
U-92



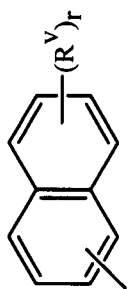
U-96



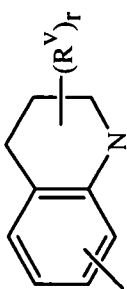
U-100



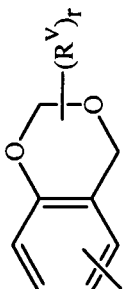
U-104



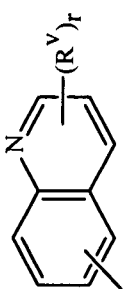
U-105



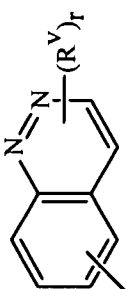
U-109



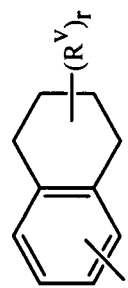
U-113



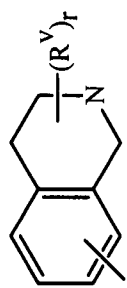
U-117



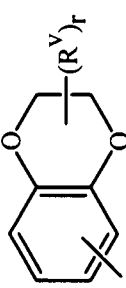
U-121



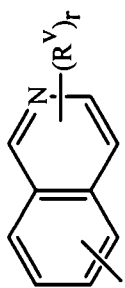
U-106



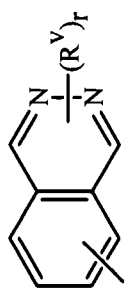
U-110



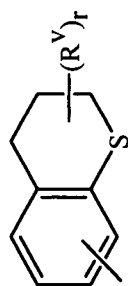
U-114



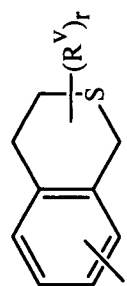
U-118



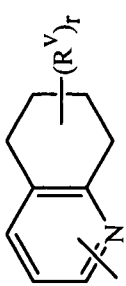
U-122



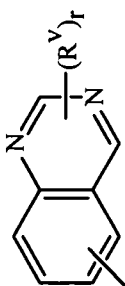
U-107



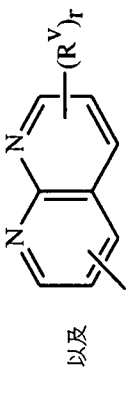
U-111



U-115

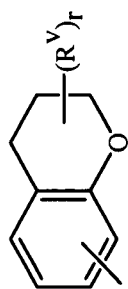


U-119

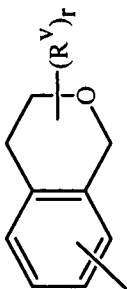


U-123

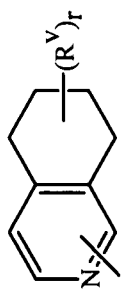
以及



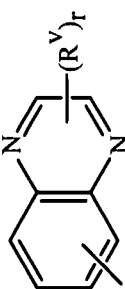
U-108



U-112



U-116



U-120

**【0039】** 雖在結構 U-1 至 U-123 中顯示有  $R^v$  基團，應值得注意的是該等基團不需要存在因為其為可選擇的取代基。值得注意的是當  $R^v$  在接附至一原子時為 H，此係如同該原子為未經取代。需要取代以填補其價的氮原子係經 H 或  $R^v$  取代。值得注意的是當  $(R^v)_r$  及 U 基團之間的接附點係繪示成浮動時， $(R^v)_r$  可接附至該 U 基團上之任何可用的碳原子或氮原子。值得注意的是當 U 基團上的接附點係繪示成浮動時，該 U 基團可透過 U 基團上任何可用的碳或氮，藉由取代氮原子來接附至式 1 之其餘部分。值得注意的是是一些 U 基團可僅經少於 4 個  $R^v$  基團取代（例如，U-2 至 U-5、U-7 至 U-48 及 U-52 至 U-61）。

**【0040】** 在該領域中已知有許多不同的合成方法能製備芳香族及非芳香族的雜環和環系；相關方法的廣泛回顧請參見八卷集的 *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, A. R. Katritzky and C. W. Rees editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1984 以及十二卷集的 *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, A. R. Katritzky, C. W. Rees and E. F. V. Scriven editors-in-chief, Pergamon Press, Oxford, 1996。

**【0041】** 本發明的化合物可以存在為一個或多個立體異構物。立體異構物係組成相同但原子之空間排列不同的異構物，包括鏡像異構物、非鏡像異構物、順反異構物（亦已知為幾何異構物）及阻轉異構物。阻轉異構物係由於相對於單鍵之旋轉受限而造成，其中旋轉障壁高到足以容許異構物種之分離。熟習該項技術者將理解到，當一種立體異構物相對於其他立體異構物更為濃化時，或者與其他立體異構物分離時，其可更具活性及/或展現有益效果。此外，熟習該項技術者知

道如何分離、濃化及/或選擇性地製備所述立體異構物。關於立體異構現象之所有面向的綜合討論，請參見 Ernest L. Eliel and Samuel H. Wilen, *Stereochemistry of Organic Compounds*, John Wiley & Sons, 1994。

【0042】 本發明包含所有立體異構物、構形異構物與上述者之所有比例之混合物以及同位素形式如氘化化合物。

【0043】 熟習該領域技藝之人士將明瞭，並非所有的含氮雜環均可形成 *N*-氧化物，因為該氮需要一個可得的孤立電子對以氧化成為氧化物；熟悉該項技術之人士將能辨別出那些可形成 *N*-氧化物的含氮雜環。熟悉該項技術之人士也將明瞭三級胺可以形成 *N*-氧化物。製備雜環及三級胺之 *N*-氧化物的合成方法為熟悉該項技術之人士中眾所皆知，包括以如過氧乙酸和 3-氯過氧苯甲酸(MCPBA)的過氧酸、過氧化氫、如第三丁基過氧化氫的烷基氫過氧化物、過硼酸鈉及如二甲基雙環氧乙烷的雙環氧乙烷來氧化雜環及三級胺。這些製備 *N*-氧化物的方法已在文獻中被廣泛描述及回顧，例如，見：T. L. Gilchrist in *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748–750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press；M. Tisler and B. Stanovnik in *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18–20, A. J. Boulton and A. McKillop, Eds., Pergamon Press；M. R. Grimmett and B. R. T. Keene in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149–161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press；M. Tisler and B. Stanovnik in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285–291, A. R.

Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press ; 以及 G. W. H. Cheeseman and E. S. G. Werstiuk in *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390–392, A. R. Katritzky and A. J. Boulton, Eds., Academic Press 。

**【0044】** 熟習該項技術者會瞭解到，因為化合物的鹽類與它們對應的非鹽形式在環境和生理條件下會處於平衡狀態，所以鹽類會分享非鹽形式的生物效用。因此式 1 化合物的廣泛各式鹽類可用來防治無脊椎動物害蟲。式 1 化合物的鹽類包括含有機酸或無機酸的酸添加鹽類，如氫溴酸、鹽酸、硝酸、磷酸、硫酸、乙酸、丁酸、延胡索酸、乳酸、順丁烯二酸、丙二酸、草酸、丙酸、水楊酸、酒石酸、4-甲苯磺酸或戊酸。當式 1 化合物包含一個酸性的部分，像是羧酸或酚，鹽類亦包含那些以有機或無機鹼形成之鹽類，像是吡啶、三乙胺或氨，或醯胺、氫化物、氫氧化物或鈉、鉀、鋰、鈣、鎂或鋇之碳酸鹽。因此，本發明包含選自式 1、其 *N*-氧化物與合適鹽類的化合物。

**【0045】** 選自式 1、其立體異構物、互變異構物、*N*-氧化物及鹽類的化合物，通常存在不止一種形式，且式 1 因此包括式 1 表示的化合物的所有晶形和非晶形。非結晶形式包括像是蠟和膠的固體實施例，也包括像是溶液和熔體的液體實施例。結晶形式包括基本上代表一單晶類型的實施例及代表一多形體（即不同的結晶類型）混合物的實施例。用語「多形體」意指一可以結晶成不同結晶形式之化合物的特定晶形，這些形式的晶格內分子有不同的排列及/或構形。雖然多形體可具有相同之化學組成，它們亦可有不同的組成，因為有或無共結

晶之水或其他分子的存在，其可弱或強地鍵結於晶格內。多形體可以在化學、物理和生物特性有所不同，像是晶體形狀、密度、硬度、顏色、化學穩定性、熔點、吸濕性、懸浮率、溶解速率和生物利用度。熟悉該項技術之人士將明瞭，式 1 所描繪的一化合物之一多形體相對於式 1 所描繪的同樣化合物之另一個多形體或多形體混合物，可展示出有益的效果（例如，適合製備有用的配方、改進生物效能）。式 1 所描繪的一化合物之一特定多形體的製備和分離可以藉由熟悉該項技術之人士所熟知的方法完成，包括例如，使用選定的溶劑和溫度來結晶。本發明的化合物可存在為一或多種結晶質多形體。本發明同時包含個別多形體與多形體之混合物，包括其中一種多形體相對於其他者為濃化的混合物。關於多形體現象的綜合討論，請參見 R. Hilfiker, Ed., *Polymorphism In the Pharmaceutical Industry*, Wiley-VCH, Weinheim, 2006。

**【0046】** 如發明內容中所述之本發明的實施例包括以下所述者。在下列實施例中，提及「一式 1 化合物」時包括在發明內容中所指定的取代基定義，除非該等實施例中另有定義。

**【0047】** 實施例 1。一式 1 化合物，其中 Q 為 Q-1、Q-2 或 Q-3。

**【0048】** 實施例 2。一式 1 化合物，其中 Q 為 Q-1、Q-2 或 Q-3，且  $Y^3$  為  $CR^{5b}$ 。

**【0049】** 實施例 3。一式 1 化合物，其中 Q 為 Q-1 或 Q-2。

**【0050】** 實施例 4。一式 1 化合物，其中 Q 為 Q-1。

【0051】 實施例 5。一式 1 化合物，其中 Q 為 Q-1，且 Y1 為 O 或 S。

【0052】 實施例 6。一式 1 化合物，其中 Q 為 Q-1，且 Y1 為 S。

【0053】 實施例 7。一式 1 化合物，其中 Q 為 Q-1，且 Y1 為 O。

【0054】 實施例 8。一式 1 化合物，其中 Q 為 Q-2。

【0055】 實施例 9。一式 1 化合物，其中 Q 為 Q-2，且 Y2 為 CR5a。

【0056】 實施例 10。一式 1 或實施例 1 至 9 中任一者之化合物，其中 A 為 CH、CR<sup>1</sup>或 N，且 R<sup>1</sup>為鹵素。

【0057】 實施例 11。一實施例 10 之化合物，其中 A 為 CH、CF 或 N。

【0058】 實施例 11a。一實施例 10 之化合物，其中 A 為 CF 或 N。

【0059】 實施例 12。一實施例 10 之化合物，其中 A 為 CH 或 CF。

【0060】 實施例 13。一實施例 10 之化合物，其中 A 為 CH。

【0061】 實施例 14。一實施例 10 之化合物，其中 A 為 N。

【0062】 實施例 15。一式 1 或實施例 1 至 9 中任一者之化合物，其中 m 為 1，且 R<sup>1</sup>為 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基或鹵素。

【0063】 實施例 16。一實施例 15 之化合物，其中  $R^1$  為  $CF_3$ 、 $OMe$ 、 $Me$  或  $F$ 。

【0064】 實施例 17。一實施例 16 之化合物，其中  $R^1$  為  $CF_3$ 、 $OMe$ 、 $Me$  或  $F$ ，且係在 4 位。

【0065】 實施例 18。一實施例 17 之化合物，其中  $R^1$  為  $CF_3$ ，且係在 4 位。

【0066】 實施例 19。一式 1 或實施例 1 至 9 中任一者之化合物，其中  $m$  為 0。

【0067】 實施例 20。一式 1 或實施例 1 至 19 中任一者之化合物，其中  $X^1$  為  $CR^2$ ，且  $X^2$ 、 $X^3$  及  $X^4$  各獨立為  $CR^3$ ；或  $X^2$  為  $CR^2$ ，且  $X^1$ 、 $X^3$  及  $X^4$  各獨立為  $CR^3$ 。

【0068】 實施例 21。一實施例 20 之化合物，其中  $X^1$  為  $CR^2$ ，且  $X^2$ 、 $X^3$  及  $X^4$  各獨立為  $CR^3$ 。

【0069】 實施例 22。一實施例 20 之化合物，其中  $X^2$  為  $CR^2$ ，且  $X^1$ 、 $X^3$  及  $X^4$  各獨立為  $CR^3$ 。

【0070】 實施例 23。一式 1 或實施例 1 至 22 中任一者之化合物，其中各  $R^3$  獨立為  $H$  或鹵素。

【0071】 實施例 24。一實施例 23 之化合物，其中各  $R^3$  獨立為  $H$  或  $F$ 。

【0072】 實施例 25。一實施例 24 之化合物，其中各  $R^3$  為  $H$ 。

【0073】 實施例 26。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $C(=Z)NR^6R^7$ 、 $C(=NR^{10})R^{11}$  或  $Q^a$ 。



【0074】 實施例 27。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $C(=NR^{10})R^{11}$ 。

【0075】 實施例 28。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $C(=NR^{10})R^{11}$ ； $R^{10}$  為  $C_1$ - $C_4$  烷氧基；且  $R^{11}$  為  $C_1$ - $C_4$  烷基，其經  $S(O)_nR^{23}$  取代。

【0076】 實施例 29。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $C(=Z)NR^6R^7$  或  $Q^a$ 。

【0077】 實施例 30。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $C(=Z)NR^6R^7$ 。

【0078】 實施例 31。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $C(=O)NR^6R^7$ 。

【0079】 實施例 32。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $C(=S)NR^6R^7$ 。

【0080】 實施例 33。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $C(=O)NR^6R^7$ ；且  $R^6$  為  $H$ 、 $C(O)OR^{21}$ 、 $C(O)R^{22}$  或  $C_1$ - $C_6$  烷基。

【0081】 實施例 35。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $C(=O)NR^6R^7$ ；且  $R^6$  為  $H$ 、 $C(O)OMe$ 、 $C(O)Me$  或甲基。

【0082】 實施例 36。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $C(=O)NR^6R^7$ ；且  $R^6$  為  $H$ 。

【0083】 實施例 36a。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $C(=O)NR^6R^7$ ；且  $R^6$  為  $C(O)OMe$ 。

【0084】 實施例 36b。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $C(=O)NR^6R^7$ ；且  $R^6$  為  $C(O)Me$ 。

【0085】 實施例 36c。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $C(=O)NR^6R^7$ ；且  $R^6$  為甲基。

【0086】 實施例 37。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $Q^a$ 。

【0087】 實施例 38。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $Q^a$ ；且  $Q^a$  為 5 或 6 員芳環，各環含有選自碳原子與至多 3 個雜原子之環員，該至多 3 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 3 個氮原子，各環為未經取代或經至少一個  $R^x$  取代。

【0088】 實施例 39。一式 1 或實施例 1 至 25 中任一者之化合物，其中  $R^2$  為  $Q^a$ ；且  $Q^a$  為 5 或 6 員雜芳環，各環含有選自碳原子與至多 3 個雜原子之環員，該至多 3 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 3 個氮原子，各環為未經取代或經至少一個  $R^x$  取代。

【0089】 實施例 40。一實施例 39 之化合物，其中該雜芳環為 5 員雜芳環。

【0090】 實施例 41。一實施例 40 之化合物，其中該雜芳環為 5 員雜芳環，其具有一氮原子在 2 位。

【0091】 實施例 42。一實施例 39 之化合物，其中該雜芳環為 6 員雜芳環。

【0092】 實施例 43。一實施例 42 之化合物，其中該雜芳環為 6 員雜芳環，其具有一氮原子在 2 位。

【0093】 實施例 44。一實施例 43 之化合物，其中該雜芳環為 6 員雜芳環，其具有一氮原子在 2 位且經 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基取代。

【0094】 實施例 45。一實施例 44 之化合物，其中該雜芳環為 6 員雜芳環，其具有一氮原子在 2 位且經 CF<sub>3</sub> 取代。

【0095】 本發明之實施例（包括上述實施例 1 至 45 以及本文中所述之任何其他實施例）可以任何方式組合，且實施例中之變項說明不僅適用於式 1 化合物，亦適用於可用於製備式 1 化合物之起始化合物及中間化合物。此外，本發明之實施例（包括上述實施例 1 至 45 及本文中所述之任何其他實施例）以及任何彼等之組合皆適用於本發明之組成物及方法。

【0096】 實施例 1 至 45 之組合說明：

實施例 A。一式 1 化合物，其中

X<sup>1</sup> 為 CR<sup>2</sup>，且 X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup> 及 X<sup>4</sup> 各獨立為 CR<sup>3</sup>；或 X<sup>2</sup> 為 CR<sup>2</sup>，且 X<sup>1</sup>、X<sup>3</sup> 及 X<sup>4</sup> 各獨立為 CR<sup>3</sup>。

實施例 B。一實施例 A 化合物，其中

Q 為 Q-1 或 Q-2。

實施例 C。一實施例 B 化合物，其中

Q 為 Q-1；以及

$Y^1$  為 O 或 S。

實施例 D。一實施例 C 化合物，其中

Q 為 Q-2；以及

$Y^2$  為  $CR^{5a}$ 。

實施例 E。一實施例 A-D 中任一者之化合物，其中

A 為 CH 或 CF；以及

m 為 0。

實施例 F。一式 1 化合物，其中

A 為 CH 或 CF；

m 為 0；

Q 為 Q-2；

$Y^2$  為  $CR^{5a}$ ；

$X^1$  為  $CR^2$  且  $X^2$ 、 $X^3$  及  $X^4$  各為 CH；或  $X^2$  為  $CR^2$  且  $X^1$ 、 $X^3$  及  $X^4$  為

CH；

$R^2$  為  $C(=Z)NR^6R^7$  或  $Q^a$ 。

實施例 G。一式 1 化合物，其中

A 為 CH 或 CF；

m 為 0；

Q 為 Q-2；

$Y^2$  為  $CR^{5a}$ ；

$X^1$  為  $CR^2$  且  $X^2$ 、 $X^3$  及  $X^4$  各為 CH；

$R^2$  為  $C(=Z)NR^6R^7$  或  $Q^a$ 。

實施例 H。一式 1 化合物，其中

A 為 CH 或 CF；

m 為 0；

Q 為 Q-2；

$Y^2$  為  $CR^{5a}$ ；

$X^2$  為  $CR^2$  且  $X^1$ 、 $X^3$  及  $X^4$  為 CH；

$R^2$  為  $C(=Z)NR^6R^7$  或  $Q^a$ 。

實施例 I。一式 1 化合物，其中

A 為 CH；

m 為 0；

Q 為 Q-2；

$Y^2$  為  $CR^{5a}$ ；

$R^{5a}$  為 H；

$X^1$  為  $CR^2$  且  $X^2$ 、 $X^3$  及  $X^4$  各為 CH；或  $X^2$  為  $CR^2$  且  $X^1$ 、 $X^3$  及  $X^4$  為 CH；

$R^2$  為  $C(O)NR^6R^7$ ；以及

$R^6$  為 H。

實施例 J。一式 1 化合物，其中

A 為 CH；

m 為 0；

Q 為 Q-2；

$Y^2$  為  $CR^{5a}$ ；

$R^{5a}$  為 H ；

$X^1$  為  $CR^2$  且  $X^2$ 、 $X^3$  及  $X^4$  各為 CH ；

$R^2$  為  $C(O)NR^6R^7$  ； 以及

$R^6$  為 H 。

實施例 K。一式 1 化合物，其中

A 為 CH ；

m 為 0 ；

Q 為 Q-2 ；

$Y^2$  為  $CR^{5a}$  ；

$R^{5a}$  為 H ；

$X^2$  為  $CR^2$  且  $X^1$ 、 $X^3$  及  $X^4$  為 CH ；

$R^2$  為  $C(O)NR^6R^7$  ； 以及

$R^6$  為 H 。

**【0097】** 特定實施例包括選自由下列所組成之群組的式 1 化合物

(化合物編號參照索引表 A-N) ；

*N*-(1-甲基乙基)-2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-4-甲醯胺 (化合物 8) ；

*N*-環丙基-2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-4-甲醯胺 (化合物 14) ；

*N*-環己基-2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-4-甲醯胺 (化合物 16) ；

2-(3-吡啶基)-*N*-(2,2,2-三氟乙基)-2*H*-吡啶-4-甲醯胺 (化合物 19) ；

2-(3-吡啶基)-*N*-[(四氫-2-呋喃基)甲基]-2*H*-吡啶-5-甲醯胺 (化合物 41) ；

2-[[2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-5-基]羰基]胍甲酸甲酯 (化合物 42) ；

*N*-[(2,2-二氟環丙基)甲基]-2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-5-甲醯胺 (化合物 51) ；

*N*-(2,2-二氟丙基)-2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-5-甲醯胺 (化合物 54) ；

2-(3-吡啶基)-*N*-(2-噁啶甲基)-2*H*-吡啶-5-甲醯胺 (化合物 55) ； 以及

*N*-[(5-甲基-2-吡【口+井】基)甲基]-2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-5-甲醯胺

(化合物 76)。

**【0098】** 值得注意的是，本發明化合物之特徵在於有利之代謝及/或土壤殘留模式，且展示防治許多農藝及非農藝無脊椎動物害蟲之活性。

**【0099】** 尤其值得注意的是，出於無脊椎動物害蟲防治範圍及經濟價值之原因，藉由防治無脊椎動物害蟲來保護農作物免遭無脊椎動物害蟲造成之損害或傷害為本發明之實施例。本發明之化合物由於在植物中有良好的易位特性或系統性，因此也可保護並未直接接觸到式 1 化合物或包含該化合物之組成物的葉子或其他植物部分。

**【0100】** 本發明另外值得注意的實施例為組成物，其包含任何先前實施例及本文中所述之任何其他實施例的一化合物，與上述者之任何組合，及至少一選自由一界面活性劑、一固體稀釋劑及一液體稀釋劑所組成之群組的額外組分，該組成物可選擇地進一步包含至少一額外生物活性化合物或藥劑。

**【0101】** 本發明進一步值得注意的實施例為用於防治無脊椎動物害蟲的組成物，其包含任何先前實施例及本文中所述之任何其他實施例的一化合物，與上述者之任何組合，以及至少一種選自由一界面活性劑、一固體稀釋劑與一液體稀釋劑所組成之群組的額外組分，該組成物可選擇地進一步包含至少一額外生物活性化合物或藥劑。本發明之實施例進一步包括防治一無脊椎動物害蟲之方法，其包含使一無脊

椎動物害蟲或其環境與一生物有效量的任何先前實施例之一化合物（例如，作為本文中所述之一組成物）接觸。

**【0102】** 本發明之實施例也包括一形式為土壤澆灌液液體配方的組成物，其包含任何先前實施例之一化合物。本發明之實施例進一步包括用於防治一無脊椎動物害蟲之方法，其包含使土壤與一呈土壤澆灌液形式之液體組成物接觸，該液體組成物包含一生物有效量的任何先前實施例之一化合物。

**【0103】** 本發明之實施例亦包括一用於防治一無脊椎動物害蟲之噴霧組成物，該噴霧組成物包含一生物有效量的任何先前實施例之一化合物以及一推進劑。本發明之實施例進一步包括一用於防治一無脊椎動物害蟲之誘餌組成物，其包含一生物有效量的任何先前實施例之一化合物、一或多種食物材料、可選擇地一引誘劑與可選擇地一保濕劑。本發明之實施例亦包括一種用於防治一無脊椎動物害蟲之裝置，其包含該誘餌組成物及一適合收納該誘餌組成物之外殼，其中該外殼具有至少一開口，該開口之尺寸訂定為允許該無脊椎動物害蟲通過該開口，因此該無脊椎動物害蟲可自外殼外部之位置進入攝食該誘餌組成物，且其中該外殼進一步適合置放在無脊椎動物害蟲之潛在或已知活動地點或其附近。

**【0104】** 本發明之實施例亦包括用於保護一種子免於一無脊椎動物害蟲之方法，其包含使該種子與一生物有效量的任何先前實施例之一化合物接觸。



【0105】 本發明之實施例亦包括保護一動物免於一無脊椎動物寄生性害蟲之方法，其包含對該動物投予一殺寄生蟲有效量的任何先前實施例之化合物。

【0106】 本發明之實施例亦包括用於防治一無脊椎動物害蟲之方法，其包含使該無脊椎動物害蟲或其環境與一生物有效量的一式 **1** 化合物、其一 *N*-氧化物或一鹽（例如，作為本文中所述之一組成物）接觸，前提是該等方法並非透過治療來醫療一人類或動物身體之方法。

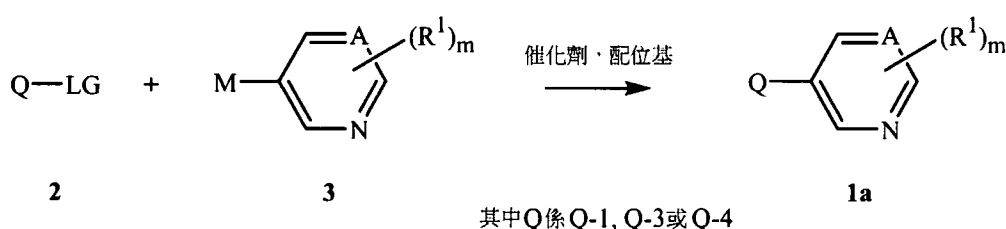
【0107】 本發明亦涉及此類使該無脊椎動物害蟲或其環境與一組成物接觸之方法，該組成物包含一生物有效量之一式 **1** 化合物，其一 *N*-氧化物或一鹽，以及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑與液體稀釋劑所組成之群組的額外組分，該組成物可選擇地進一步包含一生物有效量的至少一種額外生物活性化合物或藥劑，前提是該等方法並非透過治療來醫療一人類或動物身體之方法。

【0108】 如方案 1 至 13 中所述之一或多種下列方法及變化型可用於製備式 **1** 化合物。以下式 **1** 至 **23** 化合物中之取代基定義係如以上於發明內容中所定義者，除非另有註明。式 **1a** 至 **1g** 化合物為式 **1** 化合物的各式子集合，並且所有用於式 **1a** 至 **1g** 之所有取代基係如以上針對式 **1** 所定義者。使用下列縮寫：THF 為四氫呋喃，DMF 為 *N,N*-二甲基甲醯胺，NMP 為 *N*-甲基吡咯啉酮，Ac 為乙酸根，MS 為甲磺酸根，Tf 為三氟甲磺酸根，且 Nf 為九氟丁磺酸根(nonaflate)。

【0109】 式 **1a** (Q 為 Q-1、Q-3 或 Q-4 之式 **1**) 化合物可如方案 1 中所示藉由使式 **2** (其中 LG 為合適脫離基如 Cl、Br、I、Tf 或 Nf)

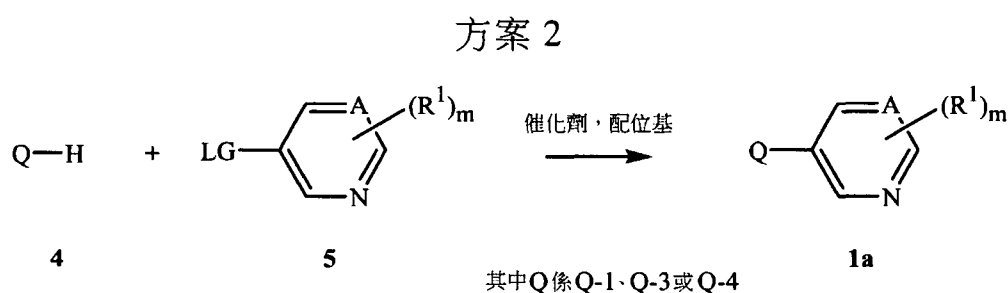
雜環化合物與式 3 (其中 M 為合適金屬或類金屬如 Mg、Zn 或 B 物種) 雜環化合物於催化劑與適當配位基存在下偶合來製備。催化劑可產生自過渡金屬如 Pd (例如 Pd(OAc)<sub>2</sub> 或 Pd<sub>2</sub>(dba)<sub>3</sub>) 與單或二牙配位基如 PPh<sub>3</sub>、PCy<sub>3</sub>、Pt-Bu<sub>3</sub>、x-phos、xantphos、s-phos 及 dppf。所用之典型鹼包括碳酸鹽類如碳酸鈉或碳酸銨、磷酸鹽類如三磷酸鉀、胺類如乙基二異丙胺或烷氧化物如三級丁氧化鈉。典型溶劑包括 THF、二【口+罈】烷(dioxane)、甲苯、乙醇、DMF、水或上述者之混合物。典型反應溫度範圍從環境溫度至溶劑沸點。

### 方案 1



**【0110】** 式 1a (Q 為 Q-1、Q-3 或 Q-4 之式 1) 化合物亦可如方案 2 中所示藉由使式 4 化合物與式 5 (其中 LG 為合適脫離基如 Cl、Br、I、Tf 或 Nf) 化合物於催化劑與適當配位基存在下偶合來製備。各種不同催化劑可用於方案 2 方法中，並且這些催化劑可產生自過渡金屬物種如銅或 Pd (例如錯合物如 Pd(OAc)<sub>2</sub> 或 Pd<sub>2</sub>(dba)<sub>3</sub>) 與配位基。典型配位基可為單或二牙，並且包括 PPh<sub>3</sub>、PCy<sub>3</sub>、Pt-Bu<sub>3</sub>、x-phos、xantphos、s-phos 與 dppf。所用之典型鹼包括碳酸鹽類如碳酸鈉或碳酸銨、磷酸鹽類如三磷酸鉀、胺類如乙基二異丙胺或烷氧化物如三級丁氧化鈉。添加劑如分子篩、Bu<sub>4</sub>N<sup>+</sup>Br<sup>-</sup> 或銅或銀鹽 (例如

AgOAc) 可為有益者。典型反應溶劑包括 THF、二【口+号】烷、甲苯、乙醇、DMF、水或上述者之混合物。典型反應溫度範圍從環境溫度至溶劑沸點。例如，請參見 *Chemical Communications* **2011**, 47(17), pages 5043-5045 ; *Journal of the American Chemical Society* **2010**, 132(11), pages 3674-3675 ; *Heterocycles* **2011**, 83(6), pages 1371-1376 ; 美國專利申請案公開第 20090076266 號 ; *Bulletin of the Chemical Society of Japan* **1998**, 71(2), pages 467-473 ; *Tetrahedron Letters* **2008**, 49(10), pages 1598-1600 ; 及 *Tetrahedron Letters* **2010**, 51(42), pages 5624-5627 。

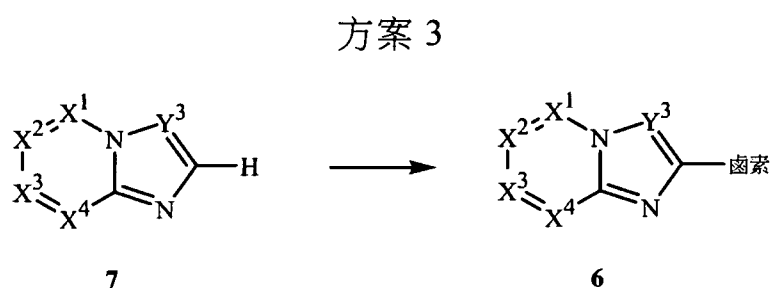


【0111】 LG 為鹵素之式 2 化合物可製備自其對應之胺類，此係藉由用 ON<sup>+</sup>源如亞硝酸異戊酯或亞硝酸三級丁酯或亞硝酸於鹵素源如 CuBr<sub>2</sub> 或 BnNEt<sub>3</sub><sup>+</sup>Br<sup>-</sup>存在下處理而達成。較佳反應條件包括水性或有機溶劑如 THF 或乙腈，並且反應溫度範圍從 0°C 至溶劑沸點。

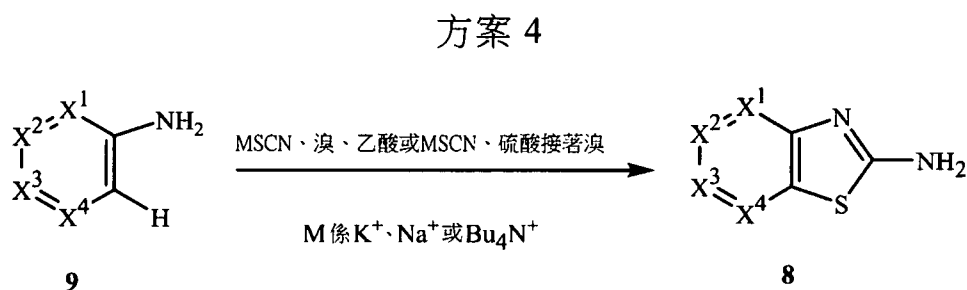
【0112】 LG 為 Cl 或 Br 之式 2 化合物亦可製備自對應之羥基化合物，此係藉由用鹵化劑如 POCl<sub>3</sub>、PCl<sub>5</sub>、PBr<sub>3</sub> 或 SOCl<sub>2</sub> 處理而達成。LG 為 OMS 或 OTf 之式 2 化合物亦可製備自對應之羥基化合物，此係藉由用 MsCl 或 Tf<sub>2</sub>O 處理而達成。

【0113】 式 4 化合物可製備自對應之胺化合物，此係藉由用  $\text{ON}^+$  源如亞硝酸異戊酯或亞硝酸三級丁酯處理而達成。較佳反應條件包括醚類溶劑如 THF，並且溫度範圍從環境溫度至溶劑沸點。

【0114】 式 6 化合物可利用親電子鹵化對應之式 7 化合物來製備，此係藉由用鹵化劑如 *N*-溴琥珀醯亞胺在合適溶劑如 DMF、NMP 或乙酸中在範圍從環境溫度至高達溶劑沸點的溫度下處理而達成（方案 3）。

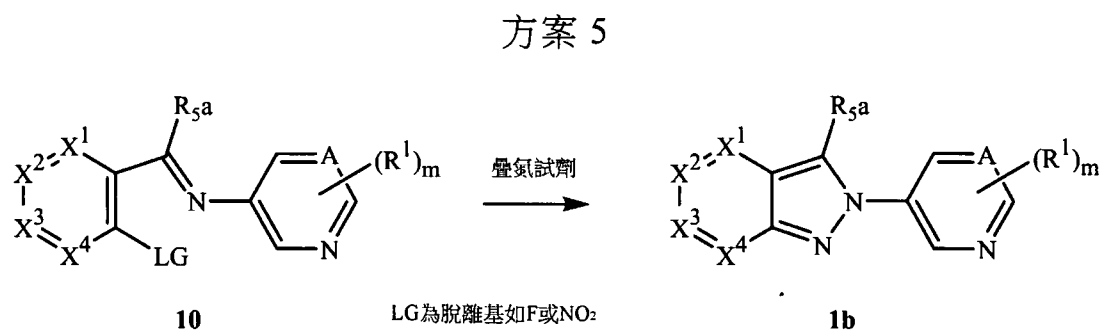


【0115】 式 8 之 2-胺基苯并噻唑可製備自式 9 之鄰位未經取代苯胺與硫基氰酸鹽陰離子（其中 M 為  $\text{K}^+$ 、 $\text{Na}^+$  或  $\text{Bu}_4\text{N}^+$ ），如方案 4 中所示。該反應可例如在乙酸中以單步驟進行，或者透過硫基-脲中介接著氧化來進行。合適氧化劑包括溴。

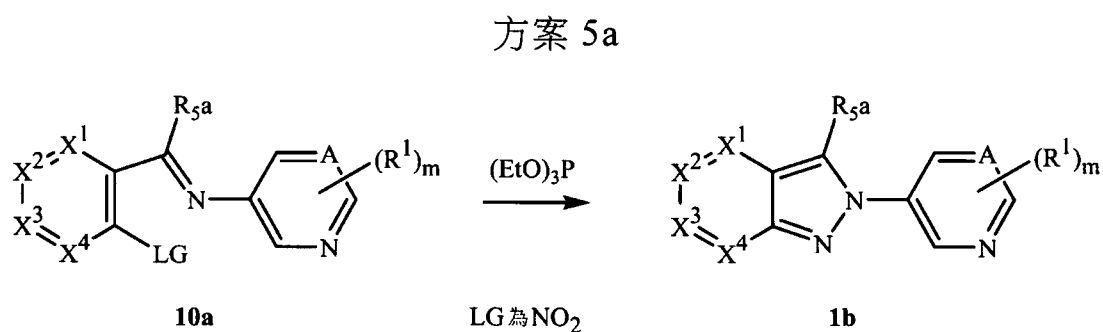


【0116】 式 1b 化合物可藉由方案 5 中所示之方法製備自式 10 化合物，在該方法中式 10 化合物係用疊氮試劑（例如，疊氮化鈉或疊氮

化四丁基銨) 來處理。典型反應條件包括以 DMF 或 NMP 作為溶劑，並且反應溫度範圍從 80°C 至溶劑沸點。



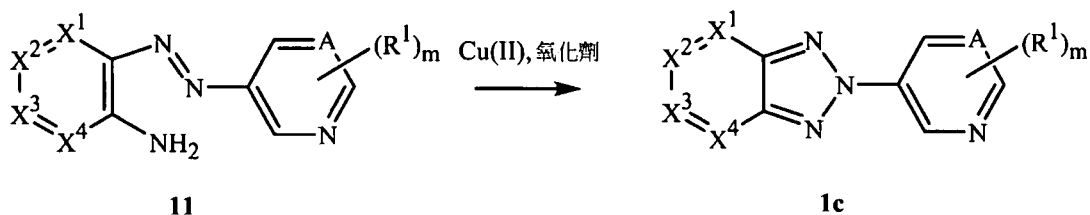
【0117】 式 1b 化合物亦可藉由方案 5a 中所示之方法製備自式 10a 化合物，在該方法中式 10a 化合物係用亞磷酸三乙酯來處理。



【0118】 式 10 及 10a 化合物皆為希夫鹼，並且可藉由該項技術領域中習知之方法來製備（例如請參見 March, J., *Advanced Organic Chemistry*, Wiley, 1992, pages 896-898）。

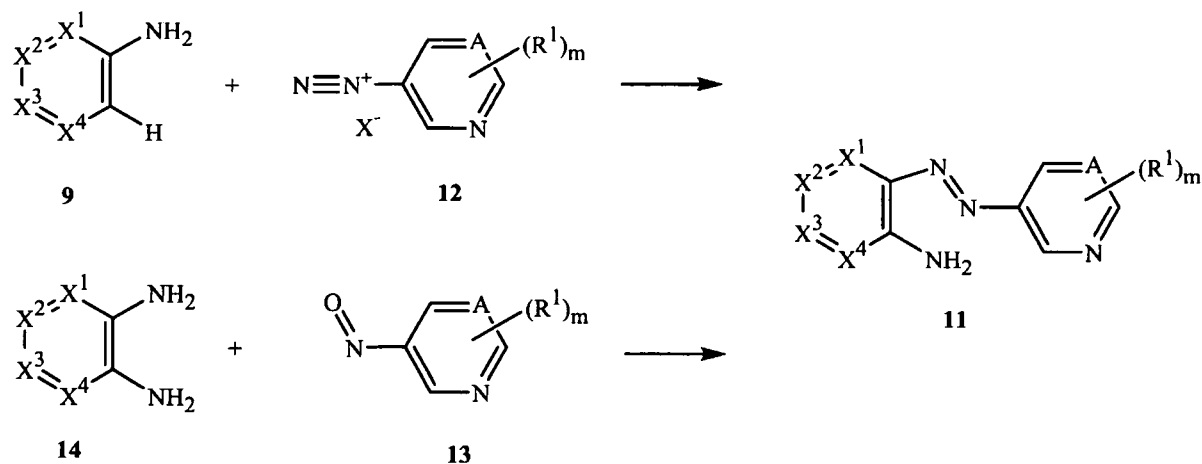
【0119】 式 1c 化合物可藉由方案 6 中所示之方法製備自式 11 化合物，此係經由以分子氧或過氧化物如過氧化三級丁基於銅(II)催化劑如 Cu(OAc)<sub>2</sub> 或 CuBr<sub>2</sub> 存在下氧化式 11 化合物而達成。典型反應條件包括醇類溶劑如三級戊醇、DMF、NMP 或氨水溶液，並且反應溫度從 60°C 至溶劑沸點。

## 方案 6



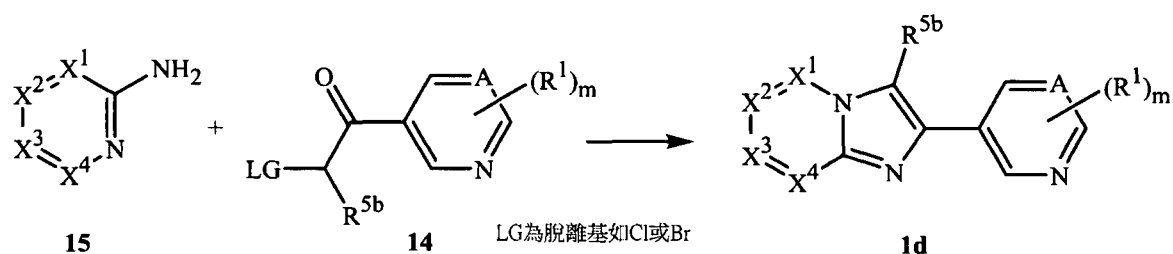
【0120】 式 **11** 之 2-胺基偶氮化合物可透過使式 **9** 之苯胺與式 **12** 重氮鹽反應來製備，此係藉由該項技術領域習知之方法來達成（例如請參見 March, J., *Advanced Organic Chemistry*, Wiley, 1992, pages 525-526）。式 **11** 化合物亦可透過使式 **13** 之芳基亞硝基化合物與式 **14** 之二胺在溶劑如乙酸中反應來製備。這兩種方法係示於方案 7 中。

## 方案 7



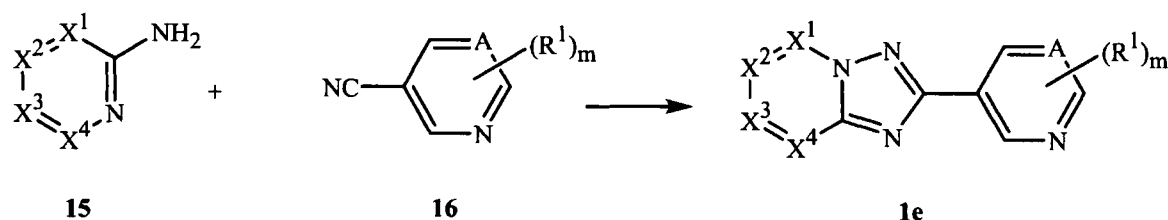
【0121】 式 **1d** 化合物可透過用式 **16** 之胺吡啶或胺二【口+井】（aminodiazine）縮合式 **14** 化合物（其中  $Lg$  為合適脫離基如  $Cl$  或  $Br$ ）來製備，如方案 8 中所示。典型反應條件包括醇類溶劑如乙醇或甲苯，並且反應溫度範圍從環境溫度至溶劑沸點。吡啶氮可為可選擇地經保護為  $BH_3$  加成物、 $N$ -氧化物或 2-或 6-鹵基吡啶衍生物。

## 方案 8



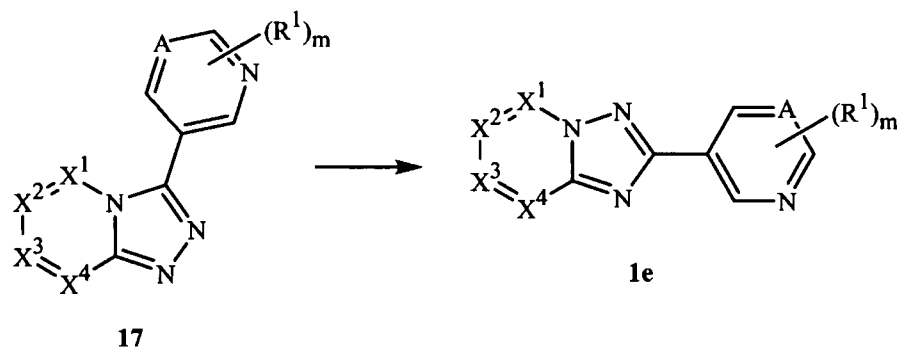
【0122】 式 **1e** 化合物可如方案 9 中所示透過用式 **16** 芳基腈環加成式 **15** 之 2-胺吡啶來製備（例如請參見 *Journal of the American Chemical Society* **2009**, 131(42), pages 15080-15081，以及 WO 2013041472）。

## 方案 9



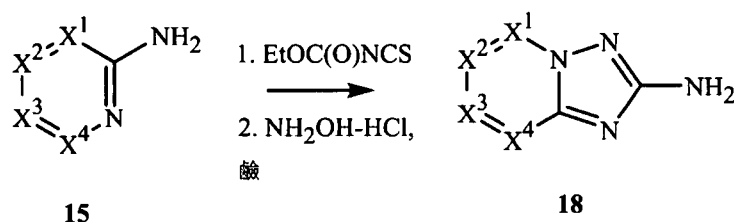
【0123】 式 **1e** 亦可透過重排式 **17** 化合物來製備，此係如方案 10 中所示藉由用鹼處理來達成（例如請參見 *J. Het Chem* **1970**, 7 page 1019）。式 **17** 化合物可透過下列文獻中所述之方法來製備：WO 2008006540 及 *J. Org. Chem.*, **1966**, page 251。

## 方案 10



【0124】 式 **18** 之中間物可透過方案 11 中所示之方法來製備，此係藉由用異氰酸酯接著用羥胺與合適鹼如三乙胺處理式 **15** 之 2-胺吡啶而達成。

## 方案 11

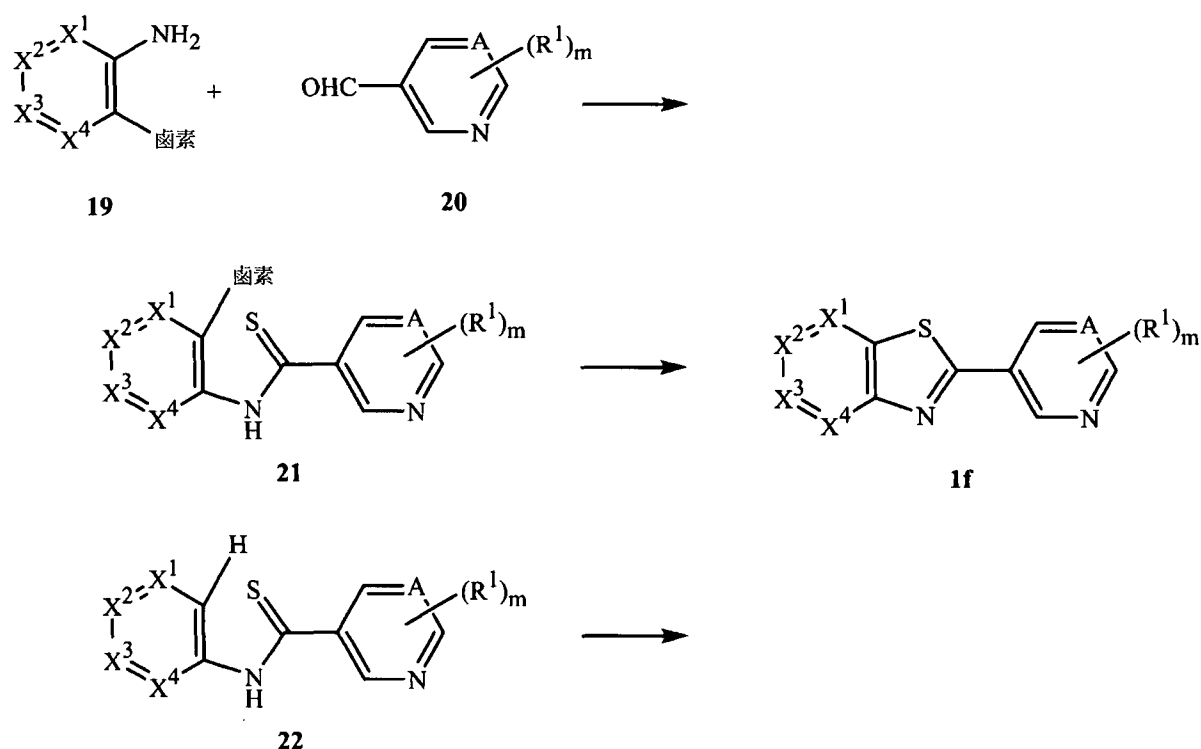


【0125】 Q 為 Q-4 之式 **1** 化合物亦可透過合成實例 6 中所述之方法來製備。

【0126】 式 **1f** 化合物可如方案 12 中所示透過用式 **19** 之苯胺（帶有鄰位鹵素，較佳為碘）氧化性環化式 **20** 之芳基醛來製備，此係於硫（同時作用為硫源與氧化劑）存在下進行。該反應係於鹼如  $K_2CO_3$  存在下在合適溶劑如水或 DMF 中進行，並且係透過加入銅鹽（例如，CuI 或  $CuCl_2$ ）且較佳為加入合適配位基如 1,10-啡啉來催化。典型反應溫度範圍從  $70^\circ C$  至溶劑沸點。



## 方案 12



【0127】 式 **1f** 化合物亦可如方案 12 中之第二反應所示透過用鹼（諸如  $\text{KOtBu}$ 、 $\text{NaH}$ 、 $\text{DBU}$  或  $\text{Cs}_2\text{CO}_3$ ）環化式 **21** 之 2-鹵基硫醯胺來製備，此係在合適溶劑如甲苯或 DMF 中進行，並且可選擇地加入銅鹽如  $\text{CuI}$  且較佳為加入合適配位基如 1,10-啡啉。此反應亦可透過 Pd 物種如製備自  $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$  與  $(t\text{-Bu})_2\text{P-}o\text{-聯苯}$  者、鹼如  $\text{Cs}_2\text{CO}_3$  來催化，此係在合適溶劑如 1,2-二甲氧乙烷或二【口+号】烷中進行。典型反應溫度範圍從  $80^\circ\text{C}$  至溶劑沸點。關於銅與 Pd 催化之反應，式 **21** 化合物上之鹵素取代基較佳為 Br 或 I。例如，請參見 *Journal of Organic Chemistry* **2006**, 71(5), pages 1802-1808 ; *Tetrahedron Letters* **2003**, 44(32), pages 6073-6077 ; *Synthetic Communications* **1991**, 21(5), pages 625-33 ; 及歐洲專利申請案第 450420 號。

【0128】 式 1f 化合物亦可透過如方案 12 之第三反應中所示氧化性環化式 22 之硫醯胺來製備。此方法典型使用之氧化劑包括溴或碘、DDQ 與  $K_3Fe(CN)_6$ 。例如，請參見 *Tetrahedron* **2007**, 63(41), pages 10276-10281 ; *Synthesis* **2007**, (6), 819-823 ; 及美國專利申請公開案第 20120215154 號。

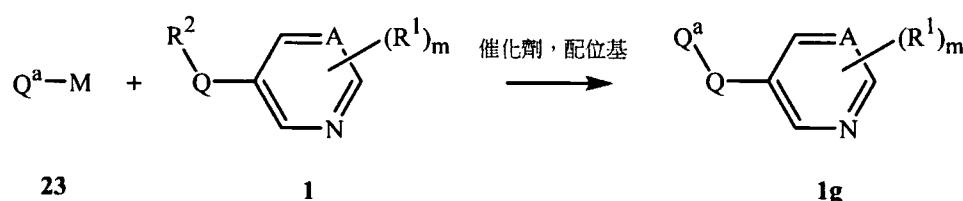
【0129】 方案 12 中所述之三種方法皆可用來製備  $X^1-X^4$  為碳原子之化合物，或  $X^1-X^4$  其中一者為氮之化合物（例如，請參見 *J. Heterocyclic Chem.* **2009**, 46, page 1125 以及其中所引用之參考文獻）。

【0130】 式 1 化合物與式 1 化合物之製備中所用的中間物（其中 Z 為 S 者）可透過例如用勞森試劑(CAS No. 19172-47-5)、貝羅試劑(CAS No. 88816-02-8)或  $P_2S_5$  硫化(thionation)對應之化合物（其中 Z 為 O）來製備。該硫化反應典型在溶劑如甲苯、二甲苯或二【口+罈】烷中，並且在升溫（從 80°C 至溶劑沸點）下進行。

【0131】 式 1 化合物（其中  $R^2$  為  $C(O)NR^6R^7$  者）可透過羰基化對應之化合物（其中  $R^2$  為鹵素者，較佳為 Br 或 I，或其中  $R^2$  為磺酸根者，例如三氟甲磺酸根或九氟丁磺酸根）來製備。該反應係於一氧化碳源如一氧化碳氣體或  $Mo(CO)_6$  存在下在介於常壓與 25 bar 之間的壓力下執行（可選擇地伴隨微波加熱），並且通常在升溫（在 80 至 160°C 的範圍中）下進行。典型反應溶劑包括 DMF、NMP、甲苯或醚類溶劑如 THF 或二【口+罈】烷。

【0132】 式 1 化合物（其中  $R^2$  為  $Q^a$  者）可如方案 13 中所示製備。方案 13 之方法類似於方案 1 中所述之方法；M 為合適金屬或類金屬如 Mg、Zn 或 B 物種，並且  $R^2$  對應方案 1 中之 LG 且為合適脫離基如 Cl、Br、I、Tf 或 Nf。

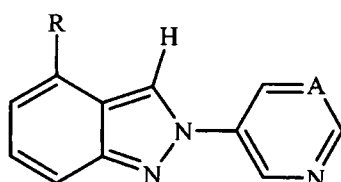
方案 13



【0133】 式 1 化合物（其中  $R^2$  為  $Q^a$  且  $Q^a$  係經由  $Q^a$  中之氮原子鍵結至 Q 者）可透過類似方案 13 之方法來製備。在此方法中，式 23 化合物中之 M 為氫。偶合試劑包括銅(I)鹽如 CuI 與合適配位基如反-雙(N,N-二甲基-1,2-環己烷二胺)。典型反應條件包括溶劑如甲苯或二【口+罈】烷，以及範圍從 80°C 至溶劑沸點的升高反應溫度。

【0134】 可用於製備本發明化合物的中間物實例顯示於表 I-1 至表 I-16。下表中所用之縮寫如下面所示：Me 意指甲基，Et 意指乙基，Ph 意指苯基，C(O)意指羰基而 CHO 意指甲醯基。

表 I-1



A 為 CH

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	氰基
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-硝苯基)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>
硝基	

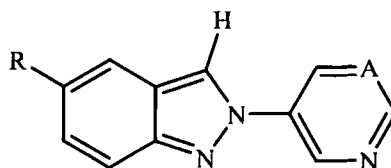
## A 為 CF

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	氰基
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-硝苯基)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>
硝基	

## A 為 N

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	氰基
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-硝苯基)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>
硝基	

表 I-2



## A 為 CH

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	氰基
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-硝苯基)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>
硝基	

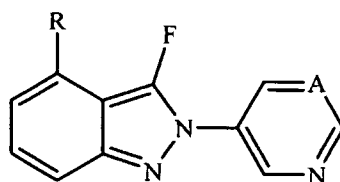
## A 為 CF

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	氰基
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-硝苯基)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>
硝基	

## A 為 N

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	氰基
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-硝苯基)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>
硝基	

表 I-3



## A 為 CH

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	氰基
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-硝苯基)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>
硝基	

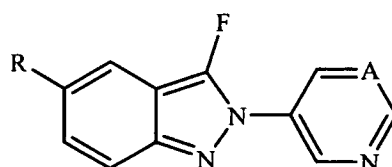
## A 為 CF

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	氰基
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-硝苯基)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>
硝基	

## A 為 N

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	氰基
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-硝苯基)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NH <sub>2</sub>
硝基	

表 I-4



## A 為 CH

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	氰基
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-硝苯基)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O)2CF3	NH2
硝基	

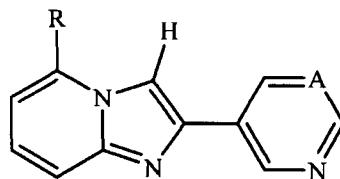
A 為 CF

R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	氰基
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-硝苯基)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O)2CF3	NH2
硝基	

A 為 N

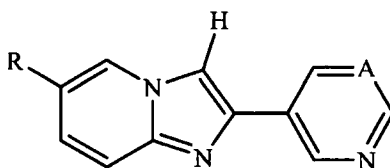
R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	氰基
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-硝苯基)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O)2CF3	NH2
硝基	

表 I-5



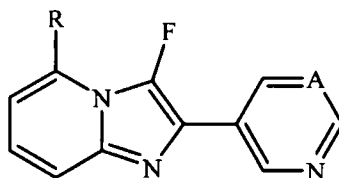
【0135】 表 I-5 與表 I-1 相同，除了標題「表 1-1」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 I-6



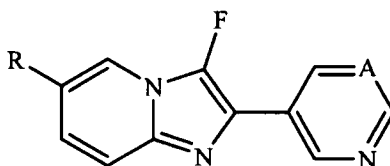
【0136】 表 I-6 與表 I-1 相同，除了標題「表 1-1」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 I-7



【0137】 表 I-7 與表 I-1 相同，除了標題「表 1-1」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

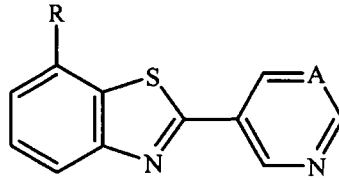
表 I-8



【0138】 表 I-8 與表 I-1 相同，除了標題「表 1-1」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

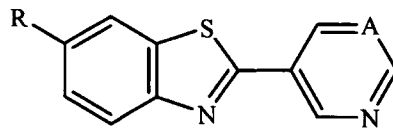


表 I-9



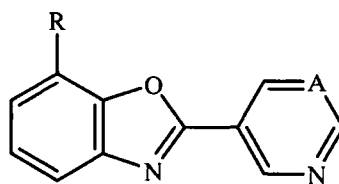
【0139】 表 I-9 與表 I-1 相同，除了標題「表 1-1」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 I-10



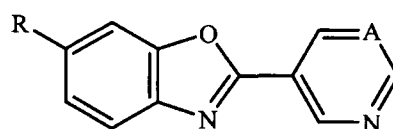
【0140】 表 I-10 與表 I-1 相同，除了標題「表 1-1」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 I-11



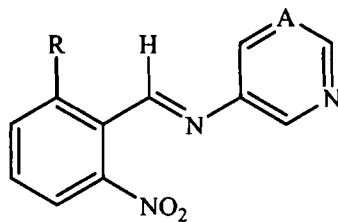
【0141】 表 I-4 與表 I-1 相同，除了標題「表 1-1」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 I-12



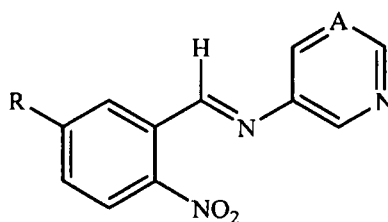
【0142】 表 I-4 與表 I-1 相同，除了標題「表 1-1」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 I-13



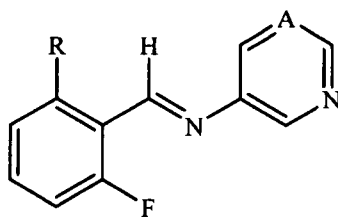
【0143】 表 I-13 與表 I-1 相同，除了標題「表 1-1」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 I-14



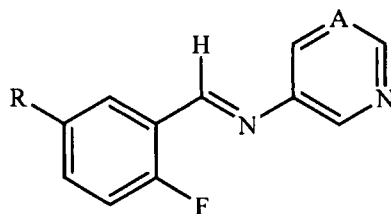
【0144】 表 I-14 與表 I-1 相同，除了標題「表 1-1」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 I-15



【0145】 表 I-15 與表 I-1 相同，除了標題「表 1-1」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 I-16



【0146】 表 I-16 與表 I-1 相同，除了標題「表 1-1」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

【0147】 應了解的是，上述用於製備式 1 化合物的一些試劑及反應條件可能與某些存在於中間物的官能性不相容。在這些情況中，將保護/去保護次序或官能基相互轉換併入合成中，將有助於獲得所欲產物。保護基的使用和選擇對熟習化學合成之技藝人士而言是顯而易見的（參見例如 Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2nd ed.; Wiley:New York, 1991）。熟習該項技術者將了解在某些情況下，在引入個別方案中所繪示之試劑後，可能需要未詳細描述之額外常規合成步驟以完成式 1 化合物之合成。熟習該項技術者也會認知到，可能必須將上述方案中所說明的步驟以一種不同於其所呈現之特定順序所意味的次序組合，以製備出式 1 化合物。

【0148】 熟悉該項技術之人士也將認識到本文中所述之式 1 化合物及中間物可經各種親電子反應、親核反應、自由基反應、有機金屬反應、氧化反應及還原反應處理以添加取代基或修飾現有的取代基。

**【0149】** 即使沒有進一步的闡述，相信使用上述說明的熟習該項技術者仍能夠最大程度地利用本發明。因此，下面的合成實例應理解為僅僅是說明性的，且不以任何方式作為對本揭露的限制。下列合成實例中的步驟，說明在整個合成轉換中每一步驟的製程，且每個步驟的起始材料不一定非得由在其他實例或步驟中敘述的特別製備流程之製程來製備。百分比係以重量計，除了層析溶劑混合物或另有指明者。除非特別說明，否則層析溶劑混合物係指體積份及體積百分比。<sup>1</sup>H NMR 光譜以偏離四甲基矽烷的低場 ppm 記載；「s」意指單峰、「d」意指雙峰、「t」意指三重峰、「q」意指四重峰、「m」意指多重峰、「dd」意指雙二重峰、「dt」意指雙三重峰、「br s」意指寬單峰。DMF 意指 *N,N*-二甲基甲醯胺。化合物編號參照索引表 A-N。

### 合成實例 1

N-[2-(甲硫基)乙基]-2-(3-吡啶基)-7-苯并噻唑甲醯胺（化合物 84）之製備

步驟 A：3-[(胺基硫酮基甲基)胺基]苯甲酸乙酯之製備

**【0150】** 將 3-胺基苯甲酸乙酯(35.25 g, 213.6 mmol)溶於氯苯(250 mL)然後冷卻至-10°C。將濃硫酸(5.93 mL)加入接著加入 KSCN(21.76 g)與 18-冠-6 (600 mg)，然後將反應混合物在 100°C 下加熱 14 小時。將己烷加至冷卻之混合物，然後將沉澱固體藉由過濾分離。使固體在水與己烷之混合物中漿化，然後攪拌漿液 1 小時。將固體藉由過濾分離然後真空乾燥整夜以提供呈灰色固體之標題化合物(40.7 g)。

$^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$ :10.10 + 9.87 (two s, 1H), 8.08 + 8.05 (two s, 1H), 7.66-7.80 (m, 2H), 7.43-7.51 (m, 1H), 8.0-7.0 (br s, 2H), 4.28-4.35 (m, 2H), 1.29-1.35 (m, 3H)。

#### 步驟 B：2-胺基-7-苯并噻唑甲酸乙酯之製備

**【0151】** 將步驟 A 之產物置於氯仿(300 mL)與乙酸(200 mL)中然後將溴(21 mL) (在氯仿(100 mL)中) 逐滴加入經過 1.5 小時。接著將反應混合物在 70°C 下加熱 4 小時、冷卻、過濾然後將分離出之固體用 50 mL 的 1:1 丙酮/氯仿洗滌。將固體加至  $\text{Na}_2\text{CO}_3$  (25 g) 在水(400 mL)中之溶液中然後攪拌 20 分鐘。將懸浮液過濾，然後將分離出之固體用水洗滌並真空乾燥整夜以提供呈白色固體之標題化合物(6.73 g)。將有機濾液濃縮然後於 100 mL 的 1:1 氯仿/丙酮中再漿化，並且如上所述處理以提供額外 8.1 g 的白色固體 (90%純度，其餘 10%為位置異構苯并噻唑)。 $^1\text{H}$  NMR (DMSO- $d_6$ )  $\delta$ :7.66 (dd,  $J=7.7, 0.9$  Hz, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.57 (dd, 1H), 7.35 (t,  $J=7.8$  Hz, 1H), 4.37 (q,  $J=7.1$  Hz, 2H), 1.36 (t,  $J=7.1$  Hz, 3H)。

#### 步驟 C：2-氯-7-苯并噻唑甲酸乙酯之製備

**【0152】** 將步驟 B 之產物(7.97 g, 9:1 位置異構物混合物, 35.9 mmol)分成數份在 45 分鐘期間在 65°C 下加至亞硝酸三級丁酯(7.1 mL)與  $\text{CuCl}_2$  (5.31 g)在乙腈(360 mL)中之混合物。在攪拌額外 15 分鐘後，將冷卻之混合物用己烷萃取 6 次。將合併之萃取物濃縮以提供呈

黃色固體之標題化合物(5.85 g)。將乙腈層用水(200 mL)稀釋、用己烷萃取然後將己烷萃取物通過矽膠墊過濾(用氯化丁基溶析)以在濃縮後產出額外 0.55 g 的產物。<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ:8.14 (d, 2H), 7.58 (t, 1H), 4.49 (q, J=7.1 Hz, 2H), 1.47 (t, J=7.2 Hz, 3H)。

步驟 D: 2-(3-吡啶基)-7-苯并噻唑甲酸之製備

**【0153】** 將步驟 C 之產物(6.2 g, 9:1 位置異構物混合物)與 3-吡啶硼酸(3.79 g)、PPh<sub>3</sub> (1.35 g)與 Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (5.44 g)在甲苯(100 mL)、水(25 mL)與乙醇(15 mL)中合併,然後將反應混合物用氮起泡 5 分鐘。將 Pd<sub>2</sub>dba<sub>3</sub> (588 mg)加入,然後將反應混合物在回流下加熱 4 小時。將冷卻之反應混合物用水稀釋、用二氯甲烷萃取兩次然後將合併之有機萃取物以 MgSO<sub>4</sub> 乾燥並濃縮。將殘餘物藉由管柱層析法純化(矽膠,以在己烷中之 10%至 50%乙酸乙酯溶析)以提供橘色固體(6.7 g)。自乙醇(25 mL)中再結晶以產出標題化合物之乙酯(5.65 g),其呈單一所欲位置異構物。<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ:9.38 (br s, 1H), 8.75 (br s, 1H), 8.44 (dt, J=8.0, 1.9 Hz, 1H), 8.30 (dd, J=8.2, 1.1 Hz, 1H), 8.19 (dd, J=7.6, 1.1 Hz, 1H), 7.62 (t, 1H), 7.47 (dd, J=8.4, 4.4 Hz, 1H), 4.53 (q, J=7.2 Hz, 2H), 1.50 (t, J=7.2 Hz, 3H)。

**【0154】** 將以上所獲得之產物溶於乙醇(100 mL)中然後用 1N 的 NaOH 溶液(24.8 mL)處理。將反應混合物在回流下加熱 1.5 小時,之後將其冷卻、用濃 HCl (2.0 mL)中和然後濃縮。將殘餘物真空乾燥以

提供標題化合物與 NaCl 之混合物，其未經進一步純化即使用於下一個步驟中。

步驟 E：N-[2-(甲硫基)乙基]-2-(3-吡啶基)-7-苯并噻唑甲醯胺之製備

【0155】 將亞硫醯氯(40 mL)加至步驟 D 之產物(0.55 g)，然後將反應混合物在回流下加熱 3 小時。接著將反應混合物冷卻然後濃縮。將所得殘餘物懸浮於甲苯中然後濃縮以產出粗醯氯，其未經進一步純化即使用。

【0156】 將粗醯氯(含 120 mol% NaCl, 114 mg, 0.3 mmol)用二氯甲烷(5 mL)、MeSCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> (33 μL)與三乙胺(125 μL)處理，然後將反應混合物在環境溫度下攪拌 14 小時。將反應混合物用飽和 NaHCO<sub>3</sub> 水溶液稀釋、用二氯甲烷萃取兩次然後以 MgSO<sub>4</sub> 乾燥。將合併之有機層濃縮，然後將殘餘物藉由管柱層析法純化（矽膠，以在己烷中之 30%乙酸乙酯至 100%乙酸乙酯溶析）以提供 65 mg 的標題化合物，即本發明之化合物。<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ:9.39 (d, J=1.7 Hz, 1H), 8.74 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.40-8.47 (dt, 1H), 8.26 (dd, J=8.0, 0.9 Hz, 1H), 7.71 (dd, J=7.6, 0.9 Hz, 1H), 7.58-7.64 (t, 1H), 7.47 (dd, J=7.2, 5.0 Hz, 1H), 6.94 (br t, 1H), 3.75-3.82 (q, 2H), 2.80-2.88 (t, 2H), 2.18 (s, 3H)。

## 合成實例 2

2-(5-氟-3-吡啶基)-N-(2,2,2-三氟乙基)-6-苯并噻唑甲醯胺（化合物

127) 之製備

步驟 A：2-(5-氟-3-吡啶基)-6-苯并噻唑甲酸之製備

【0157】 將 4-胺基-3-碘苯甲酸甲酯(1.93 g, 6.96 mmol)與  $K_2CO_3$  (1.92 g)、 $S_8$  (668 mg)、 $CuCl_2 \cdot 2H_2O$  (119 mg)、1,10-啡啉(125 mg)及 5-氟-3-吡啶羧醛(957 mg)在  $H_2O$  (30 mL)中合併，然後將反應混合物在回流下加熱 16 小時。將冷卻之反應混合物過濾，然後將濾液用  $NH_4Cl$  (1.49 g)處理。將反應混合物在環境溫度下攪拌 10 分鐘、過濾然後將固體真空乾燥以產出灰色固體。將固體懸浮於二【口+罅】烷中、將懸浮液加熱以回流、冷卻然後過濾以分離出固體。將固體用乙醚潤洗以提供標題化合物(0.66 g)。 $^1H$  NMR ( $DMSO-d_6$ )  $\delta$ :9.15 (s, 1H), 8.80 (d,  $J=2.7$  Hz, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.39 (dt,  $J=9.5, 2.2$  Hz, 1H), 8.10 (d, 1H), 8.05 (d, 1H), 8.0-6.5 (br s)。

步驟 B：2-(5-氟-3-吡啶基)-*N*-(2,2,2-三氟乙基)-6-苯并噻唑甲醯胺之製備

【0158】 將亞硫醯氯(5 mL)加至步驟 A 之產物(0.66 g)，然後將混合物在回流下加熱 16 小時。接著將反應混合物冷卻然後濃縮。將所得殘餘物懸浮於甲苯中然後濃縮以提供粗醯氯，其未經進一步純化即使用。

【0159】 將粗醯氯(103 mg, 0.31 mmol)用二氯甲烷(5 mL)、三乙胺(131  $\mu$ L)與  $CF_3CH_2NH_2$  (29  $\mu$ L)處理，然後將反應混合物在環境溫度下攪拌 3 天。將反應混合物用飽和  $NaHCO_3$  水溶液稀釋、用二氯甲



烷萃取兩次然後以  $\text{MgSO}_4$  乾燥。將合併之有機層濃縮，然後將殘餘物藉由管柱層析法純化（矽膠，以在己烷中之 20%至 40%乙酸乙酯溶析）以提供呈白色固體之標題化合物(52 mg)，即本發明之化合物。 $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ :9.32 (br s, 1H), 8.77 (d,  $J=4.3$  Hz, 1H), 8.48 (d,  $J=1.4$  Hz, 1H), 8.40 (dt,  $J=7.9, 2.0$  Hz, 1H), 8.16 (d,  $J=8.5$  Hz, 1H), 7.90 (dd,  $J=8.5, 1.7$  Hz, 1H), 7.48 (dd,  $J=7.8, 4.7$  Hz, 1H), 6.48 (br t, 1H), 4.20 (qd,  $J=9.0$  Hz, 1H)。

### 合成實例 3

*N*-(1-甲基乙基)-2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-4-甲醯胺（化合物 8）之製備

步驟 A： *N*-[(2-溴-6-氟苯基)亞甲基]-3-吡啶胺之製備

**【0160】** 將 2-溴-6-氟苯甲醛(5 g, 24.6 mmol)與 3-胺吡啶(2.7 g, 29.5 mmol)在 EtOH (4 mL)中之溶液加熱以回流整夜。將反應混合物濃縮然後將所得固體藉由管柱層析法純化（矽膠，以在己烷中之 0 至 40%乙酸乙酯溶析）以提供呈橘色固體之標題化合物(4.5 g)。 $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$ :8.66-8.70 (s, 1H), 8.48-8.53 (m, 2H), 7.52-7.58 (m, 1H), 7.41-7.48 (m, 1H), 7.31-7.37 (m, 1H), 6.95-7.06 (m, 2H)。

步驟 B： 4-溴-2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶之製備

**【0161】** 將步驟 A 之產物(4.5 g, 16.1. mmol)與  $\text{NaN}_3$  (1.2 g, 19.3 mmol)在 DMF (20 mL)中之溶液加熱至  $90^\circ\text{C}$  歷時 24 小時。將冷卻之混合物用水稀釋然後用二氯甲烷萃取 3 次。將合併之有機層乾燥

(MgSO<sub>4</sub>)、過濾、濃縮然後將殘餘物藉由管柱層析法純化（矽膠，以在己烷中之 0 至 30%乙酸乙酯溶析）以提供呈黃色固體之標題化合物 (4.0 g)。<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ:9.21 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.69 (dd, J=4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.46-8.49 (d, 1H), 8.28 (ddd, J=8.3, 2.7, 1.5 Hz, 1H), 7.73 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.50 (ddd, J=8.2, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.21 (dd, J=8.7, 7.3 Hz, 1H)。

步驟 C：N-(1-甲基乙基)-2-(3-吡啶基)-2H-吡啶-4-甲醯胺之製備

【0162】 將步驟 B 之產物(200 mg, 0.727 mmol)、異丙胺(183 μL, 2.18 mmol)、反-雙(乙酸根)雙[o-(二-o-甲苯基磷基)苄基]二鈣(II) (17 mg, 0.018 mmol)、三-三級丁基磷四氟硼酸酯(10.5 mg, 0.036 mmol)、六羰基鈾(192 mg, 0.727 mmol)、1,8-二氮雜雙環十一-7-烯 (473 μL, 2.18 mmol)與 DMF (5 mL)置於微波小瓶中然後在 160°C 下照射 40 分鐘。接著將反應混合物冷卻至室溫然後通過 Celite® 墊過濾。將濾液用飽和 NaHCO<sub>3</sub> 溶液稀釋然後用二氯甲烷萃取。將有機層乾燥 (MgSO<sub>4</sub>)、過濾、濃縮然後將殘餘物藉由管柱層析法純化（矽膠，以在氯仿中之 0 至 10%丙酮溶析）。用乙醚研製所得固體而提供呈白色固體之標題化合物(45 mg)，即本發明之化合物。<sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>) δ:9.26 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.09 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.67 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.29 (ddd, J=8.3, 2.6, 1.4 Hz, 1H), 7.92 (dt, J=8.5, 0.9 Hz, 1H), 7.48 (m, 1H), 7.31-7.41 (m, 2H), 6.15 (s, 1H), 4.31-4.41 (m, 1H), 1.33 (d, J=6.6 Hz, 6H)。

## 合成實例 4

2-(3-吡啶基)-*N*-[1-(2,2,2-三氟乙基)]咪唑并[1,2-*a*]吡啶-6-甲醯胺（化合物 457）之製備

步驟 A：2-(3-吡啶基)咪唑并[1,2-*a*]吡啶-6-甲酸甲酯之製備

**【0163】** 在進行美國專利申請公開案第 20110189794 號中之程序後，於 6-氨基菸鹼酸甲酯(5.0 g, 33 mmol)在乙醇(140 mL)中之混合物中在 60°C 下加入固體碳酸氫鈉(5.52 g, 65.7 mmol)，接著加入 3-(溴乙醯基)吡啶溴化氫鹽(10.16 g, 36.2 mmol)。將所得混合物加熱以回流 9 小時。接著將反應混合物冷卻、濃縮然後將飽和碳酸氫鈉水溶液(50 mL)與二氯甲烷(50 mL)加至所得殘餘物。水相用二氯甲烷(5 × 30 mL)萃取。將合併之有機相濃縮然後藉由管柱層析法純化（矽膠，以乙酸乙酯溶析）以提供標題化合物。

步驟 B： 2-(3-吡啶基)-*N*-[1-(2,2,2-三氟乙基)]咪唑并[1,2-*a*]吡啶-6-甲醯胺之製備

**【0164】** 將步驟 A 中所製備之酯(0.4 g, 2.4 mmol)與 NaOH 水溶液(1 N, 7.1 mL, 7.1 mmol)之混合物在甲醇(10 mL)中攪拌 2 小時。接著將反應混合物在減壓下濃縮以移除甲醇，然後將所得水溶液用 1N HCl 中和至 pH 5 以使甲酸沉澱。將固體甲酸藉由過濾分離、乾燥然後未經進一步純化即直接使用於下一個步驟中。

**【0165】** 將以上製備之甲酸(0.31 g, 1.30 mmol)、EDC-HCl (0.27 g, 1.43 mmol)、HOBt-H<sub>2</sub>O (0.22 g, 1.43 mmol)與三乙胺(0.72 mL, 5.2 mmol)在 DMF (10 mL)中之混合物在 40°C 下攪拌 30 分鐘。接著將四分之一的反應混合物體積移除、用 CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> (0.13 g, 1.3 mmol)處理然後在 40°C 下攪拌整夜。接著將反應混合物真空濃縮以移除 DMF，然後將殘餘物藉由管柱層析法純化(矽膠，以乙酸乙酯:甲醇:三乙胺 8:1:1 溶析)以獲得 43.8 mg 的標題化合物，即本發明之化合物。

#### 合成實例 5

2-[[2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-5-基]羰基]胼甲酸甲酯(化合物 42)之製備

步驟 A：4-硝基-[(3-吡啶亞胺基)甲基]苯甲酸甲酯之製備

**【0166】** 將 3-甲醯基-4-硝基苯甲酸甲酯(5 g, 25 mmol)與 3-胺吡啶(2.7 g, 30 mmol)在乙醇(4 mL)中之溶液加熱以回流整夜。接著將反應混合物冷卻、在減壓下濃縮然後將所得粗固體藉由矽膠層析法純化(以 0-40%乙酸乙酯/己烷溶析)以提供 4.5 g 呈橘色固體之標題產物。

步驟 B：2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-4-甲酸甲酯之製備

**【0167】** 將步驟 A 之產物(4.5 g, 16 mmol)與疊氮化鈉(1.2 g, 19 mmol)在 DMF (20 mL)中之溶液加熱至 90°C 歷時 16 小時。接著將反應混合物冷卻至室溫然後用水稀釋。將所得之兩層分離，然後將水層

用二氯甲烷萃取三次。將合併之有機層以硫酸鎂乾燥、過濾然後在減壓下濃縮。將所得粗固體藉由矽膠層析法純化（0-30%乙酸乙酯/己烷）以提供 4.0 g 呈黃色固體之標題產物。

#### 步驟 C：2-(3-吡啶基)-2*H*-吡唑-4-氯化羰之製備

**【0168】** 將步驟 B 中所製備之甲酯(4.1 g, 16 mmol)溶於甲醇(150 mL)，將 50%氫氧化鈉（在水(7.1 mL)中）加入然後將反應混合物加熱以回流 4 小時。接著將反應混合物冷卻至室溫，然後將溶劑在減壓下移除。將粗產物用 1N HCl 水溶液酸化，然後將所得沉澱物藉由過濾分離、用二乙醚洗滌然後在 60°C 下在減壓下乾燥整夜。接著將粗甲酸再溶於亞硫酸氯(60 mL)中，然後將反應混合物加熱至 75°C。接著將反應混合物冷卻至室溫，然後將溶劑在減壓下移除。將粗氯化羰未經純化即使用於下一個步驟中。

#### 步驟 D：2-[[2-(3-吡啶基)-2*H*-吡唑-5-基]羰基]胼甲酸甲酯之製備

**【0169】** 將步驟 C 中所製備之醯基氯化物(200 mg, 0.836 mmol)與胼基甲酸酯(82 mg, 0.91 mmol)在二氯甲烷(5 mL)中合併。將反應混合物冷卻至 0°C，然後將三乙胺(360  $\mu$ l, 2.51 mmol)逐滴加入。將反應回溫至室溫然後讓其攪拌整夜。接著將反應混合物冷卻然後用飽和碳酸氫鈉水溶液淬熄。將兩層分離，然後將水層用二氯甲烷萃取三次。將合併之有機層以硫酸鎂乾燥、過濾然後在減壓下濃縮。將所得粗固

體藉由矽膠層析法純化（20-80%乙酸乙酯/己烷）以產出呈白色固體之標題化合物，即本發明之化合物。

### 合成實例 6

2-(3-吡啶基)-*N*-[(四氫-2-呋喃基)甲基]吡啶并[1,5-*a*]吡啶-5-甲醯胺

（化合物 467）之製備

步驟 A： 3-(二甲氧基甲基)-5-(3-吡啶基)-1*H*-吡啶之製備

**【0170】** 將六甲基二矽烷鋰（55 mL 之在四氫呋喃中之 1.0M 溶液，55 毫莫耳）加至 3-乙醯吡啶(5.5 mL, 50 mmols)、甲基二甲氧基乙酸酯(6.7 mL, 55 mmols)與無水四氫呋喃(100 mL)之溶液中同時在 -45°C 下冷卻。讓所得反應混合物回溫至 25°C 經過 1 小時，然後在此溫度下攪拌 3 小時。接著將反應混合物在減壓下濃縮，然後將殘餘物懸浮於甲醇(50 mL)中並在減壓下濃縮。將所得殘餘物懸浮於甲醇(150 mL)中然後用胼單水合物(2.62 mL, 55 mmols)與冰醋酸(6.29 mL, 110 mmols)處理，並將反應混合物在回流下加熱 14 小時。將所得反應混合物冷卻至 25°C 然後在減壓下濃縮。使殘餘物分配於乙酸乙酯(200 mL)與 1N 氫氧化鈉水溶液(100 mL)之間。將層分離，然後將有機層連續用 1N 氫氧化鈉水溶液(50 mL)與鹽水(50 mL)清洗、以無水硫酸鎂乾燥然後在減壓下濃縮以產出 8.83 g 呈米黃色固體之標題化合物。

**【0171】** <sup>1</sup>H NMR (CDCl<sub>3</sub>): δ 10.5 (br s, 1H) 9.03 (d, 1H), 8.57 (dd, 1H), 8.09 (dt, 1H), 7.34 (dd, 1H), 6.65 (s, 1H), 5.63 (s, 1H), 3.39 (s, 6H)。

步驟 B：5-(3-吡啶基)-1*H*-吡啶-3-羧醛之製備

【0172】 於步驟 A 之產物(715 mg, 3.3 毫莫耳)與氯仿(5 mL)之溶液中加入三氟乙酸(2.5 mL)與水(2.5 mL)之溶液；將反應混合物溫度維持在低於 5°C（使用冰水浴）。接著將反應混合物在 0-5°C 下攪拌 2 小時、在 0°C 下用三乙胺(5 mL)處理、攪拌 15 分鐘、用水(10 mL)處理然後過濾以分離出棕色固體。將此固體用氯仿(20 mL)與水(20 mL)洗滌然後風乾以產出 605 mg 呈淡米黃色固體的標題化合物，其未經進一步純化即使用於下一個步驟中。

步驟 C：2-(3-吡啶基)吡啶并[1,5-*a*]吡啶-5-甲酸乙酯之製備

【0173】 將來自步驟 B 之產物(596 mg, 3.4 毫莫耳)、乙基-4-溴巴豆酸酯(75%, 0.95 mL, 5.2 毫莫耳)、無水碳酸鉀(1.42 g, 10.3 毫莫耳)與無水 *N,N*-二甲基甲醯胺(17 mL)之混合物在 25°C 下攪拌 14 小時。接著將反應混合物在乙酸乙酯與飽和氯化銨水溶液之間分配，然後將有機層分離、用水(3X)、鹽水洗滌、以無水硫酸鎂乾燥然後在減壓下濃縮以提供粗產物。將此所得產物藉由 MPLC 在 24 g 矽石管柱上純化（用在己烷中之 0 至 100%乙酸乙酯溶析）以提供呈淡米黃色固體之標題化合物(105 mg)。

【0174】  $^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  9.20 (d, 1H), 8.63 (dd, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.33 (d, 1H), 8.27 (dt, 1H), 7.43-7.35 (m, 2H), 7.05 (s, 1H), 4.43 (q, 2H), 1.44 (t, 3H)。

步驟 D：2-(3-吡啶基)-N-[(四氫-2-呋喃基)甲基]吡啶并[1,5-*a*]吡啶-5-甲醯胺之製備

【0175】 於來自步驟 C 之產物(31 mg, 0.11 毫莫耳)、四氫糠胺(0.12 mL, 1.2 毫莫耳)與無水甲苯(2.3 mL)之溶液中加入三甲基鋁(0.6 mL 在甲苯中的 2.0M 溶液, 1.2 毫莫耳)。將所得溶液在 25°C 下攪拌 2 小時, 在 80°C 下攪拌 2 小時, 然後冷卻至 0°C 並小心用水(3 mL)處理。將所得反應混合物在 25°C 下攪拌 15 分鐘、用飽和酒石酸鈉鉀水溶液(2 mL)處理、攪拌 30 分鐘然後在二氯甲烷與水之間分配。將有機層分離、以無水硫酸鎂乾燥然後在減壓下濃縮以分離出棕色殘餘物, 將其用二乙醚研製以產出呈米黃色固體之標題化合物(15 mg), 即本發明之化合物。

【0176】  $^1\text{H NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ ):  $\delta$  9.19 (d, 1H), 8.63 (dd, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.26 (dt, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.39 (dd, 1H), 7.16 (dd, 1H), 7.00 (s, 1H), 6.60 (br s, 1H), 4.10 (qd, 1H), 3.93 (dt, 1H), 3.89-3.76 (m, 2H), 3.38-3.29 (m, 1H), 2.11-2.02 (m, 1H), 2.00-1.83 (m, 3H)。

【0177】 藉由本文中所述之程序配合該項技術領域中習知之方法, 可製備以下表 1 至 24d 之化合物。下表中所用之縮寫如下面所示: *t* 意指三級, *s* 意指二級, *i* 意指異, *c* 意指環, Me 意指甲基, Et 意指乙基, Pr 意指丙基, Bu 意指丁基, Ph 意指苯基, OMe 意指甲氧基, OEt 意指乙氧基, SMe 意指甲硫基, SEt 意指乙硫基, -CN 意指



氰基，Ph 意指苯基，Py 意指吡啶基， $-\text{NO}_2$  意指硝基， $\text{S}(\text{O})\text{Me}$  意指甲亞磺醯基，而  $\text{S}(\text{O})_2\text{Me}$  意指甲磺醯基。

【0178】 鏈段定義開頭處的「-」代表該鏈段連接到分子其餘部分之接附點；例如「 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$ 」代表鏈段 2-甲氧乙基。環狀鏈段係使用括弧內的兩個「-」來表示；例如，鏈段 1-吡咯啉基係以「 $\text{N}(-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-)$ 」來表示，其中氮原子係同時鍵結至四碳鏈的兩個末端碳原子，如以下圖示者。

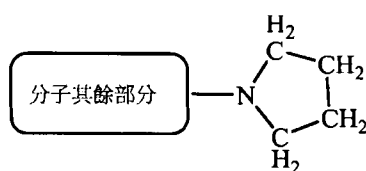
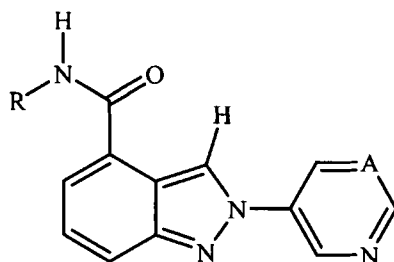


表 1a



A 為 CH

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	$-\text{CH}_2(\text{c-Pr})$	$-\text{CH}(\text{Me})(\text{c-Pr})$
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	$-\text{CH}_2\text{Ph}$	$-\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$
$-\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$-\text{C}(\text{Me})_2\text{C}\equiv\text{CH}$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{F}$
$-\text{CH}_2\text{CHF}_2$	$-\text{CH}_2\text{CF}_3$	$-\text{CH}(\text{Me})\text{CF}_3$
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	$-\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CH}_3$
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	$-\text{CH}(\text{i-Pr})\text{CF}_3$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$
$-\text{CH}_2\text{OEt}$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}(\text{i-Pr})$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OEt}$
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$	$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})\text{OMe}$	$-\text{CH}(\text{Et})\text{CH}_2\text{OMe}$
$-\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{OMe}$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})\text{Me}$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SMe}$
$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SEt}$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Me}$	$-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{Et}$

-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Et	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)(t-Bu)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(t-Bu)
-CH(Me)CH <sub>2</sub> SMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> (t-Bu)	-CH(Me)CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me
-CH(Me)CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN
-C(Me) <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(i-Pr) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me) <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	c-Pr	c-Bu
1-甲環丙基	3-甲氧基環丁基	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-硫坦基(3-thietanyl)	3,3-二氟環丁基
3-氧雜環丁烷基	-CH <sub>2</sub> (環氧乙烷基)	3-硫坦基-1,1-二氧
3-硫坦基-1-氧	-CH <sub>2</sub> (CH(-OC(Me) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -))	-CH <sub>2</sub> (四氫-2-咪喃基)
-CH <sub>2</sub> (2-咪喃基)	四氫-2-咪喃基	-CH <sub>2</sub> (2-噻吩基)
-CH <sub>2</sub> (CH(-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-))	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> (2,2-二氟環丙基)
-C(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)CO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)CO <sub>2</sub> Et	-CH(i-Pr)CO <sub>2</sub> Me
-CH <sub>2</sub> C(O)NHMe	-CH <sub>2</sub> C(O)NMe <sub>2</sub>	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe <sub>2</sub>
-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO <sub>2</sub> Me	-NHC(O)(3-吡啶基)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-己基)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-噻吩基)	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
-NHC(O)CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> Et	-NHC(O)(2-咪喃基)
-C(O)C(O)Me	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-C(O)CO <sub>2</sub> Me
-C(O)(2-吡啶基)	-NHC(O)NMe <sub>2</sub>	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NH(2-吡啶基)	-NH(3-吡啶基)
-NH(4-吡啶基)	-NH(2-噻吩基)	-NH(4-噻吩基)
-NH(5-噻吩基)	-NH(6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-NH(6-甲基-2-吡啶基)	-NH(4-甲基-2-吡啶基)
-NH(3-甲基-2-吡啶基)	-NH(5-甲基-2-噻吩基)	-NH(5-甲基-2-吡啶基)
-NH(4-甲基-2-噻吩基)	-NH(6-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(4-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(3-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(5-甲氧基-2-噻吩基)	-NH(5-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(4-甲氧基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (5-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (6-溴-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (3-(OCF <sub>3</sub> )苯基)	-CH <sub>2</sub> (2-噻唑基)
-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡【□+	-CH <sub>2</sub> (4-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)

井】基)		
Ph	3-吡啶基	-CH <sub>2</sub> (3-吡啶基)
2-吡啶基	2-吡【口+井】基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
4-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基	6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基
5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	5-CF <sub>3</sub> -2-吡【口+井】基	5-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(-C(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(O)-)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (1-咪唑基)	-CH(-C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
-CH <sub>2</sub> (4-嘧啶基)	嗒【口+井】基	6-CF <sub>3</sub> -3-吡【口+井】基

## A 為 CF

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH <sub>2</sub> Ph	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> C≡CH	-C(Me) <sub>2</sub> C≡CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F
-CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(Me)CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(i-Pr)CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe
-CH <sub>2</sub> OEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O(i-Pr)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe	-CH(Et)CH <sub>2</sub> OMe
-CH(Me)CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Et	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)(t-Bu)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(t-Bu)
-CH(Me)CH <sub>2</sub> SMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> (t-Bu)	-CH(Me)CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me
-CH(Me)CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN
-C(Me) <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(i-Pr) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me) <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	c-Pr	c-Bu
1-甲環丙基	3-甲氧基環丁基	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-硫坦基(3-thietanyl)	3,3-二氟環丁基
3-氧雜環丁烷基	-CH <sub>2</sub> (環氧乙烷基)	3-硫坦基-1,1-二氧
3-硫坦基-1-氧	-CH <sub>2</sub> (CH(-OC(Me) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -))	-CH <sub>2</sub> (四氫-2-咪喃基)
-CH <sub>2</sub> (2-咪喃基)	四氫-2-咪喃基	-CH <sub>2</sub> (2-噻吩基)
-CH <sub>2</sub> (CH(-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-))	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> (2,2-二氟環丙基)
-C(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)CO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)CO <sub>2</sub> Et	-CH(i-Pr)CO <sub>2</sub> Me
-CH <sub>2</sub> C(O)NHMe	-CH <sub>2</sub> C(O)NMe <sub>2</sub>	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe <sub>2</sub>
-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHC(O)Me	-NHC(O)(3-吡啶基)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-己基)	-NHC(O)NH(i-Pr)

-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-噁吩基)	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
-NHC(O)CF <sub>3</sub>	-NHC(O)Et	-NHC(O)(2-咪喃基)
-C(O)C(O)Me	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-C(O)CO <sub>2</sub> Me
-C(O)(2-吡啶基)	-NHC(O)NMe <sub>2</sub>	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NH(2-吡啶基)	-NH(3-吡啶基)
-NH(4-吡啶基)	-NH(2-嘧啶基)	-NH(4-嘧啶基)
-NH(5-嘧啶基)	-NH(6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基)	-NH(6-甲基-2-吡啶基)	-NH(4-甲基-2-吡啶基)
-NH(3-甲基-2-吡啶基)	-NH(5-甲基-2-嘧啶基)	-NH(5-甲基-2-吡啶基)
-NH(4-甲基-2-嘧啶基)	-NH(6-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(4-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(3-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(5-甲氧基-2-嘧啶基)	-NH(5-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(4-甲氧基-2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-溴-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (3-(OCF <sub>3</sub> )苯基)	-CH <sub>2</sub> (2-噁唑基)
-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡【□+井】基)	-CH <sub>2</sub> (4-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
Ph	3-吡啶基	-CH <sub>2</sub> (3-吡啶基)
2-吡啶基	2-吡【□+井】基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
4-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基	6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基
5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	5-CF <sub>3</sub> -2-吡【□+井】基	5-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(-C(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(O)-)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (1-咪唑基)	-CH(-C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
-CH <sub>2</sub> (4-嘧啶基)	嗒【□+井】基	6-CF <sub>3</sub> -3-吡【□+井】基

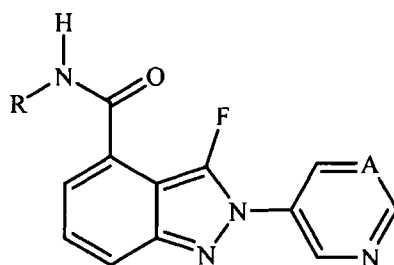
A 為 N

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH <sub>2</sub> Ph	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> C≡CH	-C(Me) <sub>2</sub> C≡CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F

-CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(Me)CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(i-Pr)CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe
-CH <sub>2</sub> OEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O(i-Pr)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe	-CH(Et)CH <sub>2</sub> OMe
-CH(Me)CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Et	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)(t-Bu)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(t-Bu)
-CH(Me)CH <sub>2</sub> SMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> (t-Bu)	-CH(Me)CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me
-CH(Me)CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN
-C(Me) <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(i-Pr) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me) <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	c-Pr	c-Bu
1-甲環丙基	3-甲氧基環丁基	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-硫坦基(3-thietanyl)	3,3-二氟環丁基
3-氧雜環丁烷基	-CH <sub>2</sub> (環氧乙烷基)	3-硫坦基-1,1-二氧
3-硫坦基-1-氧	-CH <sub>2</sub> (CH(-OC(Me) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -))	-CH <sub>2</sub> (四氫-2-咪喃基)
-CH <sub>2</sub> (2-咪喃基)	四氫-2-咪喃基	-CH <sub>2</sub> (2-噻吩基)
-CH <sub>2</sub> (CH(-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-))	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> (2,2-二氟環丙基)
-C(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)CO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)CO <sub>2</sub> Et	-CH(i-Pr)CO <sub>2</sub> Me
-CH <sub>2</sub> C(O)NHMe	-CH <sub>2</sub> C(O)NMe <sub>2</sub>	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe <sub>2</sub>
-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO <sub>2</sub> Me	-NHC(O)(3-吡啶基)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-己基)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-噻吩基)	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
-NHC(O)CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> Et	-NHC(O)(2-咪喃基)
-C(O)C(O)Me	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-C(O)CO <sub>2</sub> Me
-C(O)(2-吡啶基)	-NHC(O)NMe <sub>2</sub>	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NH(2-吡啶基)	-NH(3-吡啶基)
-NH(4-吡啶基)	-NH(2-噻啶基)	-NH(4-噻啶基)
-NH(5-噻啶基)	-NH(6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-NH(6-甲基-2-吡啶基)	-NH(4-甲基-2-吡啶基)
-NH(3-甲基-2-吡啶基)	-NH(5-甲基-2-噻啶基)	-NH(5-甲基-2-吡啶基)
-NH(4-甲基-2-噻啶基)	-NH(6-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(4-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(3-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(5-甲氧基-2-噻啶基)	-NH(5-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(4-甲氧基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-吡啶基)

-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-溴-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (3-(OCF <sub>3</sub> )苯基)	-CH <sub>2</sub> (2-噻唑基)
-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡【口+井】基)	-CH <sub>2</sub> (4-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
Ph	3-吡啶基	-CH <sub>2</sub> (3-吡啶基)
2-吡啶基	2-吡【口+井】基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
4-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基	6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基
5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	5-CF <sub>3</sub> -2-吡【口+井】基	5-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(-C(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(O)-)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (1-咪唑基)	-CH(-C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
-CH <sub>2</sub> (4-嘧啶基)	嗒【口+井】基	6-CF <sub>3</sub> -3-吡【口+井】基

表 1b



A 為 CH

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH <sub>2</sub> Ph	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> C≡CH	-C(Me) <sub>2</sub> C≡CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F
-CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(Me)CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(i-Pr)CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe
-CH <sub>2</sub> OEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O(i-Pr)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe	-CH(Et)CH <sub>2</sub> OMe
-CH(Me)CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Et	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)(t-Bu)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(t-Bu)
-CH(Me)CH <sub>2</sub> SMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> (t-Bu)	-CH(Me)CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me
-CH(Me)CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN
-C(Me) <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(i-Pr) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me) <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	c-Pr	c-Bu
1-甲環丙基	3-甲氧基環丁基	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-硫坦基(3-thietanyl)	3,3-二氟環丁基
3-氧雜環丁烷基	-CH <sub>2</sub> (環氧乙烷基)	3-硫坦基-1,1-二氧

3-硫呔基-1-氧	-CH <sub>2</sub> (CH(-OC(Me) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -))	-CH <sub>2</sub> (四氫-2-呔喃基)
-CH <sub>2</sub> (2-呔喃基)	四氫-2-呔喃基	-CH <sub>2</sub> (2-噻吩基)
-CH <sub>2</sub> (CH(-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-))	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> (2,2-二氟環丙基)
-C(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)CO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)CO <sub>2</sub> Et	-CH(i-Pr)CO <sub>2</sub> Me
-CH <sub>2</sub> C(O)NHMe	-CH <sub>2</sub> C(O)NMe <sub>2</sub>	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe <sub>2</sub>
-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO <sub>2</sub> Me	-NHC(O)(3-吡啶基)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-己基)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-噻吩基)	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
-NHC(O)CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> Et	-NHC(O)(2-呔喃基)
-C(O)C(O)Me	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-C(O)CO <sub>2</sub> Me
-C(O)(2-吡啶基)	-NHC(O)NMe <sub>2</sub>	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NH(2-吡啶基)	-NH(3-吡啶基)
-NH(4-吡啶基)	-NH(2-噻啶基)	-NH(4-噻啶基)
-NH(5-噻啶基)	-NH(6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-NH(6-甲基-2-吡啶基)	-NH(4-甲基-2-吡啶基)
-NH(3-甲基-2-吡啶基)	-NH(5-甲基-2-噻啶基)	-NH(5-甲基-2-吡啶基)
-NH(4-甲基-2-噻啶基)	-NH(6-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(4-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(3-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(5-甲氧基-2-噻啶基)	-NH(5-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(4-甲氧基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-溴-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (3-(OCF <sub>3</sub> )苯基)	-CH <sub>2</sub> (2-噻啶基)
-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡【口+井】基)	-CH <sub>2</sub> (4-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
Ph	3-吡啶基	-CH <sub>2</sub> (3-吡啶基)
2-吡啶基	2-吡【口+井】基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
4-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基	6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基
5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	5-CF <sub>3</sub> -2-吡【口+井】基	5-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(-C(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(O)-)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (1-咪啶基)	-CH(-C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
-CH <sub>2</sub> (4-噻啶基)	嗒【口+井】基	6-CF <sub>3</sub> -3-吡【口+井】基

## A 為 CF

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH <sub>2</sub> Ph	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> C≡CH	-C(Me) <sub>2</sub> C≡CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F
-CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(Me)CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(i-Pr)CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe
-CH <sub>2</sub> OEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O(i-Pr)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe	-CH(Et)CH <sub>2</sub> OMe
-CH(Me)CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Et	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)(t-Bu)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(t-Bu)
-CH(Me)CH <sub>2</sub> SMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> (t-Bu)	-CH(Me)CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me
-CH(Me)CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN
-C(Me) <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(i-Pr) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me) <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	c-Pr	c-Bu
1-甲環丙基	3-甲氧基環丁基	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-硫呔基(3-thietanyl)	3,3-二氟環丁基
3-氧雜環丁烷基	-CH <sub>2</sub> (環氧乙烷基)	3-硫呔基-1,1-二氧
3-硫呔基-1-氧	-CH <sub>2</sub> (CH(-OC(Me) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -))	-CH <sub>2</sub> (四氫-2-咪喃基)
-CH <sub>2</sub> (2-咪喃基)	四氫-2-咪喃基	-CH <sub>2</sub> (2-噁吩基)
-CH <sub>2</sub> (CH(-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-))	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> (2,2-二氟環丙基)
-C(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)CO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)CO <sub>2</sub> Et	-CH(i-Pr)CO <sub>2</sub> Me
-CH <sub>2</sub> C(O)NHMe	-CH <sub>2</sub> C(O)NMe <sub>2</sub>	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe <sub>2</sub>
-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO <sub>2</sub> Me	-NHC(O)(3-吡啶基)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-己基)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-噁吩基)	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
-NHC(O)CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> Et	-NHC(O)(2-咪喃基)
-C(O)C(O)Me	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-C(O)CO <sub>2</sub> Me
-C(O)(2-吡啶基)	-NHC(O)NMe <sub>2</sub>	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NH(2-吡啶基)	-NH(3-吡啶基)
-NH(4-吡啶基)	-NH(2-噁吩基)	-NH(4-噁吩基)
-NH(5-噁吩基)	-NH(6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-噁吩基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-噁吩基)	-NH(6-甲基-2-吡啶基)	-NH(4-甲基-2-吡啶基)
-NH(3-甲基-2-吡啶基)	-NH(5-甲基-2-噁吩基)	-NH(5-甲基-2-吡啶基)
-NH(4-甲基-2-噁吩基)	-NH(6-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(4-甲氧基-2-吡啶基)



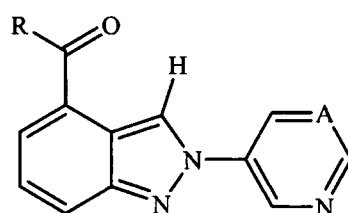
-NH(3-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(5-甲氧基-2-嘧啶基)	-NH(5-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(4-甲氧基-2-嘧啶基)	-CH2(6-CF3-2-吡啶基)	-CH2(4-CF3-2-吡啶基)
-CH2(3-CF3-2-吡啶基)	-CH2(5-CF3-2-嘧啶基)	-CH2(5-CF3-2-吡啶基)
-CH2(4-CF3-2-嘧啶基)	-CH2(6-甲基-2-吡啶基)	-CH2(4-甲基-2-吡啶基)
-CH2(3-甲基-2-吡啶基)	-CH2(5-甲基-2-嘧啶基)	-CH2(5-甲基-2-吡啶基)
-CH2(4-甲基-2-嘧啶基)	-CH2(6-甲氧基-2-吡啶基)	-CH2(4-甲氧基-2-吡啶基)
-CH2(3-甲氧基-2-吡啶基)	-CH2(5-甲氧基-2-嘧啶基)	-CH2(5-甲氧基-2-吡啶基)
-CH2(4-甲氧基-2-嘧啶基)	-CH2(5-嘧啶基)	-CH2(6-溴-2-吡啶基)
-CH2(2-嘧啶基)	-CH2(3-(OCF3)苯基)	-CH2(2-噻唑基)
-CH2(5-甲基-2-吡【口+井】基)	-CH2(4-吡啶基)	-CH2(2-吡啶基)
Ph	3-吡啶基	-CH2(3-吡啶基)
2-吡啶基	2-吡【口+井】基	-CH2CH2(2-吡啶基)
4-吡啶基	4-CF3-2-吡啶基	-CH2CH2CH2(2-吡啶基)
3-CF3-2-吡啶基	4-CF3-2-嘧啶基	6-CF3-2-吡啶基
5-CF3-2-吡啶基	5-CF3-2-吡【口+井】基	5-CF3-2-嘧啶基
-CH2CH2N(-C(O)CH2CH2C(O)-)	-CH2CH2CH2(1-咪唑基)	-CH(-C(O)OCH2CH2-)
-CH2(4-嘧啶基)	嗒【口+井】基	6-CF3-3-吡【口+井】基

## A 為 N

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH2(c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH2Ph	-CH2CH=CH2
-CH2C≡CH	-C(Me)2C≡CH	-CH2CH2F
-CH2CHF2	-CH2CF3	-CH(Me)CF3
-CH2CH2CF3	-CH2CF2CF3	-CH2CF2CH3
-CH2CH2CF2CF3	-CH(i-Pr)CF3	-CH2CH2OMe
-CH2OEt	-CH2CH2O(i-Pr)	-CH2CH2OEt
-CH2CH2CH2OMe	-CH2CH(Me)OMe	-CH(Et)CH2OMe
-CH(Me)CH2OMe	-CH2CH2S(O)Me	-CH2CH2SMe
-CH2CH2SEt	-CH2CH2SO2Me	-CH2CH2SO2Et
-CH2CH2S(O)Et	-CH2CH2S(O)(t-Bu)	-CH2CH2S(t-Bu)
-CH(Me)CH2SMe	-CH2CH2SO2(t-Bu)	-CH(Me)CH2SO2Me
-CH(Me)CH2S(O)Me	-CH2CH2S(O)CH2CF3	-CH2CH2SCH2CF3
-CH2CH2SO2CH2CF3	-CH2CH2SO2CH2CH2CF3	-CH2CH2SCH2CH2CF3
-CH2CH2S(O)CH2CH2CF3	-CH2CN	-CH2CH2CN
-C(Me)2CN	-CH2CH2N(i-Pr)2	-CH2CH2N(Me)2
-CH2CH(OMe)2	c-Pr	c-Bu
1-甲環丙基	3-甲氧基環丁基	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-硫呖基(3-thietanyl)	3,3-二氟環丁基
3-氧雜環丁烷基	-CH2(環氧乙烷基)	3-硫呖基-1,1-二氧
3-硫呖基-1-氧	-CH2(CH(-OC(Me)2OCH2-))	-CH2(四氫-2-呋喃基)

-CH <sub>2</sub> (2-咪喃基)	四氫-2-咪喃基	-CH <sub>2</sub> (2-噻吩基)
-CH <sub>2</sub> (CH(-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-))	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> (2,2-二氟環丙基)
-C(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)CO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)CO <sub>2</sub> Et	-CH(i-Pr)CO <sub>2</sub> Me
-CH <sub>2</sub> C(O)NHMe	-CH <sub>2</sub> C(O)NMe <sub>2</sub>	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe <sub>2</sub>
-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO <sub>2</sub> Me	-NHC(O)(3-吡啶基)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-己基)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-噻吩基)	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
-NHC(O)CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> Et	-NHC(O)(2-咪喃基)
-C(O)C(O)Me	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-C(O)CO <sub>2</sub> Me
-C(O)(2-吡啶基)	-NHC(O)NMe <sub>2</sub>	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NH(2-吡啶基)	-NH(3-吡啶基)
-NH(4-吡啶基)	-NH(2-噻啶基)	-NH(4-噻啶基)
-NH(5-噻啶基)	-NH(6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-NH(6-甲基-2-吡啶基)	-NH(4-甲基-2-吡啶基)
-NH(3-甲基-2-吡啶基)	-NH(5-甲基-2-噻啶基)	-NH(5-甲基-2-吡啶基)
-NH(4-甲基-2-噻啶基)	-NH(6-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(4-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(3-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(5-甲氧基-2-噻啶基)	-NH(5-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(4-甲氧基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-溴-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (3-(OCF <sub>3</sub> )苯基)	-CH <sub>2</sub> (2-噻唑基)
-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡【□+井】基)	-CH <sub>2</sub> (4-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
Ph	3-吡啶基	-CH <sub>2</sub> (3-吡啶基)
2-吡啶基	2-吡【□+井】基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
4-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基	6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基
5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	5-CF <sub>3</sub> -2-吡【□+井】基	5-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(-C(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(O)-)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (1-咪唑基)	-CH(-C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
-CH <sub>2</sub> (4-噻啶基)	嗒【□+井】基	6-CF <sub>3</sub> -3-吡【□+井】基

表 1c



A 為 CH

R	R
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH(OMe)CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C(O)(c-Pr))CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> N=CH-)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -)
N(CH <sub>2</sub> C≡CH) <sub>2</sub>	N(Et) <sub>2</sub>
N(Pr)CH <sub>2</sub> (c-Pr)	N(Et)(c-己基)
N(-CHC(O)SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	

A 為 CF

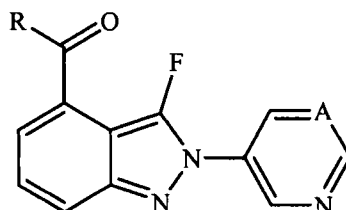
R	R
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH(OMe)CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C(O)(c-Pr))CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> N=CH-)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -)
N(CH <sub>2</sub> C≡CH) <sub>2</sub>	N(Et) <sub>2</sub>
N(Pr)CH <sub>2</sub> (c-Pr)	N(Et)(c-己基)
N(-CHC(O)SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	

A 為 N

R	R
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH(OMe)CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C(O)(c-Pr))CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> N=CH-)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -)

N(CH <sub>2</sub> C≡CH) <sub>2</sub>	N(Et) <sub>2</sub>
N(Pr)CH <sub>2</sub> (c-Pr)	N(Et)(c-己基)
N(-CHC(O)SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	

表 1d



A 為 CH

R	R
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH(OMe)CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C(O)(c-Pr))CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> N=CH-)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -)
N(CH <sub>2</sub> C≡CH) <sub>2</sub>	N(Et) <sub>2</sub>
N(Pr)CH <sub>2</sub> (c-Pr)	N(Et)(c-己基)
N(-CHC(O)SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	

A 為 CF

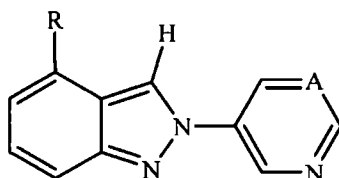
R	R
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH(OMe)CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C(O)(c-Pr))CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> N=CH-)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -)
N(CH <sub>2</sub> C≡CH) <sub>2</sub>	N(Et) <sub>2</sub>
N(Pr)CH <sub>2</sub> (c-Pr)	N(Et)(c-己基)
N(-CHC(O)SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	

A 為 N

R	R
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH(OMe)CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)

N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C(O)(c-Pr))CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> N=CH-)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -)
N(CH <sub>2</sub> C≡CH) <sub>2</sub>	N(Et) <sub>2</sub>
N(Pr)CH <sub>2</sub> (c-Pr)	N(Et)(c-己基)
N(-CHC(O)SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	

表 1e



A 為 CH

R	R
3-甲基-2-吡啶基	3-甲氧基-2-吡啶基
3-(三氟甲基)-2-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
4-甲基-2-吡啶基	4-甲氧基-2-吡啶基
4-(三氟甲基)-2-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
5-甲基-2-吡啶基	5-甲氧基-2-吡啶基
5-(三氟甲基)-2-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
6-甲基-2-吡啶基	6-甲氧基-2-吡啶基
6-(三氟甲基)-2-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
2-甲基-3-吡啶基	2-甲氧基-3-吡啶基
2-(三氟甲基)-3-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
4-甲基-3-吡啶基	4-甲氧基-3-吡啶基
4-(三氟甲基)-3-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
5-甲基-3-吡啶基	5-甲氧基-3-吡啶基
5-(三氟甲基)-3-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
6-甲基-3-吡啶基	6-甲氧基-3-吡啶基
6-(三氟甲基)-3-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
2-甲基-4-吡啶基	2-甲氧基-4-吡啶基
2-(三氟甲基)-4-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-4-吡啶基	3-甲氧基-4-吡啶基
3-(三氟甲基)-4-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-2-吡【口+井】基	3-甲氧基-2-吡【口+井】基
3-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	3-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
5-甲基-2-吡【口+井】基	5-甲氧基-2-吡【口+井】基
5-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	5-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
6-甲基-2-吡【口+井】基	6-甲氧基-2-吡【口+井】基
6-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	6-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
4-甲基-2-嘧啶基	4-甲氧基-2-嘧啶基
4-(三氟甲基)-2-嘧啶基	4-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基

5-甲基-2-嘧啶基	5-甲氧基-2-嘧啶基
5-(三氟甲基)-2-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
2-甲基-4-嘧啶基	2-甲氧基-4-嘧啶基
2-(三氟甲基)-4-嘧啶基	2-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
5-甲基-4-嘧啶基	5-甲氧基-4-嘧啶基
5-(三氟甲基)-4-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
6-甲基-4-嘧啶基	6-甲氧基-4-嘧啶基
6-(三氟甲基)-4-嘧啶基	6-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
3-甲基-1-吡啶基	3-甲氧基-1-吡啶基
3-(三氟甲基)-1-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-1-吡啶基
4-甲基-1-吡啶基	4-甲氧基-1-吡啶基
4-(三氟甲基)-1-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-1-吡啶基
5-甲基-1-吡啶基	5-甲氧基-1-吡啶基
5-(三氟甲基)-1-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-1-吡啶基
4-甲基-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-甲氧基-1,2,3-三【口+井】-2-基
4-(三氟甲基)-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-三【口+井】-2-基
6-(2-嘧啶基)-2-吡啶基	2-(2-吡啶基)-4-噁唑基
2-(2-噁唑基)-4-噁唑基	2-(2-嘧啶基)乙炔基
1,3,4-【口+罈】二唑-2-基	四氫-3-呋喃基
四氫-2-呋喃基	4,5-二氫-3-異【口+罈】唑基
3-異【口+罈】唑基	苯基
2-(三氟甲基)苯基	3-(三氟甲基)苯基
4-(三氟甲基)苯基	6-(三氟甲基)-3-吡【口+井】基

## A 為 CF

R	R
3-甲基-2-吡啶基	3-甲氧基-2-吡啶基
3-(三氟甲基)-2-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
4-甲基-2-吡啶基	4-甲氧基-2-吡啶基
4-(三氟甲基)-2-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
5-甲基-2-吡啶基	5-甲氧基-2-吡啶基
5-(三氟甲基)-2-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
6-甲基-2-吡啶基	6-甲氧基-2-吡啶基
6-(三氟甲基)-2-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
2-甲基-3-吡啶基	2-甲氧基-3-吡啶基
2-(三氟甲基)-3-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
4-甲基-3-吡啶基	4-甲氧基-3-吡啶基
4-(三氟甲基)-3-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
5-甲基-3-吡啶基	5-甲氧基-3-吡啶基
5-(三氟甲基)-3-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
6-甲基-3-吡啶基	6-甲氧基-3-吡啶基
6-(三氟甲基)-3-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-3-吡啶基

2-甲基-4-吡啶基	2-甲氧基-4-吡啶基
2-(三氟甲基)-4-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-4-吡啶基	3-甲氧基-4-吡啶基
3-(三氟甲基)-4-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-2-吡【口+井】基	3-甲氧基-2-吡【口+井】基
3-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	3-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
5-甲基-2-吡【口+井】基	5-甲氧基-2-吡【口+井】基
5-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	5-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
6-甲基-2-吡【口+井】基	6-甲氧基-2-吡【口+井】基
6-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	6-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
4-甲基-2-嘧啶基	4-甲氧基-2-嘧啶基
4-(三氟甲基)-2-嘧啶基	4-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
5-甲基-2-嘧啶基	5-甲氧基-2-嘧啶基
5-(三氟甲基)-2-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
2-甲基-4-嘧啶基	2-甲氧基-4-嘧啶基
2-(三氟甲基)-4-嘧啶基	2-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
5-甲基-4-嘧啶基	5-甲氧基-4-嘧啶基
5-(三氟甲基)-4-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
6-甲基-4-嘧啶基	6-甲氧基-4-嘧啶基
6-(三氟甲基)-4-嘧啶基	6-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
3-甲基-1-吡唑基	3-甲氧基-1-吡唑基
3-(三氟甲基)-1-吡唑基	3-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1-吡唑基	4-甲氧基-1-吡唑基
4-(三氟甲基)-1-吡唑基	4-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
5-甲基-1-吡唑基	5-甲氧基-1-吡唑基
5-(三氟甲基)-1-吡唑基	5-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-甲氧基-1,2,3-三【口+井】-2-基
4-(三氟甲基)-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-三【口+井】-2-基
6-(2-嘧啶基)-2-吡啶基	2-(2-吡啶基)-4-噻唑基
2-(2-噻唑基)-4-噻唑基	2-(2-嘧啶基)乙炔基
1,3,4-【口+号】二唑-2-基	四氫-3-咪喃基
四氫-2-咪喃基	4,5-二氫-3-異【口+号】唑基
3-異【口+号】唑基	苯基
2-(三氟甲基)苯基	3-(三氟甲基)苯基
4-(三氟甲基)苯基	6-(三氟甲基)-3-吡【口+井】基

A 為 N

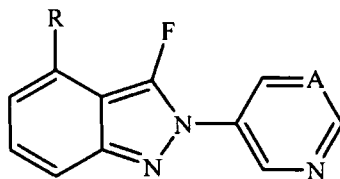
R	R
3-甲基-2-吡啶基	3-甲氧基-2-吡啶基
3-(三氟甲基)-2-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
4-甲基-2-吡啶基	4-甲氧基-2-吡啶基
4-(三氟甲基)-2-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-2-吡啶基

5-甲基-2-吡啶基	5-甲氧基-2-吡啶基
5-(三氟甲基)-2-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
6-甲基-2-吡啶基	6-甲氧基-2-吡啶基
6-(三氟甲基)-2-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
2-甲基-3-吡啶基	2-甲氧基-3-吡啶基
2-(三氟甲基)-3-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
4-甲基-3-吡啶基	4-甲氧基-3-吡啶基
4-(三氟甲基)-3-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
5-甲基-3-吡啶基	5-甲氧基-3-吡啶基
5-(三氟甲基)-3-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
6-甲基-3-吡啶基	6-甲氧基-3-吡啶基
6-(三氟甲基)-3-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
2-甲基-4-吡啶基	2-甲氧基-4-吡啶基
2-(三氟甲基)-4-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-4-吡啶基	3-甲氧基-4-吡啶基
3-(三氟甲基)-4-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-2-吡【口+井】基	3-甲氧基-2-吡【口+井】基
3-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	3-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
5-甲基-2-吡【口+井】基	5-甲氧基-2-吡【口+井】基
5-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	5-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
6-甲基-2-吡【口+井】基	6-甲氧基-2-吡【口+井】基
6-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	6-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
4-甲基-2-嘧啶基	4-甲氧基-2-嘧啶基
4-(三氟甲基)-2-嘧啶基	4-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
5-甲基-2-嘧啶基	5-甲氧基-2-嘧啶基
5-(三氟甲基)-2-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
2-甲基-4-嘧啶基	2-甲氧基-4-嘧啶基
2-(三氟甲基)-4-嘧啶基	2-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
5-甲基-4-嘧啶基	5-甲氧基-4-嘧啶基
5-(三氟甲基)-4-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
6-甲基-4-嘧啶基	6-甲氧基-4-嘧啶基
6-(三氟甲基)-4-嘧啶基	6-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
3-甲基-1-吡唑基	3-甲氧基-1-吡唑基
3-(三氟甲基)-1-吡唑基	3-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1-吡唑基	4-甲氧基-1-吡唑基
4-(三氟甲基)-1-吡唑基	4-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
5-甲基-1-吡唑基	5-甲氧基-1-吡唑基
5-(三氟甲基)-1-吡唑基	5-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-甲氧基-1,2,3-三【口+井】-2-基
4-(三氟甲基)-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-三【口+井】-2-基
6-(2-嘧啶基)-2-吡啶基	2-(2-吡啶基)-4-噁唑基
2-(2-噁唑基)-4-噁唑基	2-(2-嘧啶基)乙炔基
1,3,4-【口+号】二唑-2-基	四氫-3-咪喃基
四氫-2-咪喃基	4,5-二氫-3-異【口+号】唑基



3-異【口+号】唑基	苯基
2-(三氟甲基)苯基	3-(三氟甲基)苯基
4-(三氟甲基)苯基	6-(三氟甲基)-3-吡【口+井】基

表 1f



A 為 CH

R	R
3-甲基-2-吡啶基	3-甲氧基-2-吡啶基
3-(三氟甲基)-2-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
4-甲基-2-吡啶基	4-甲氧基-2-吡啶基
4-(三氟甲基)-2-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
5-甲基-2-吡啶基	5-甲氧基-2-吡啶基
5-(三氟甲基)-2-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
6-甲基-2-吡啶基	6-甲氧基-2-吡啶基
6-(三氟甲基)-2-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
2-甲基-3-吡啶基	2-甲氧基-3-吡啶基
2-(三氟甲基)-3-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
4-甲基-3-吡啶基	4-甲氧基-3-吡啶基
4-(三氟甲基)-3-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
5-甲基-3-吡啶基	5-甲氧基-3-吡啶基
5-(三氟甲基)-3-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
6-甲基-3-吡啶基	6-甲氧基-3-吡啶基
6-(三氟甲基)-3-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
2-甲基-4-吡啶基	2-甲氧基-4-吡啶基
2-(三氟甲基)-4-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-4-吡啶基	3-甲氧基-4-吡啶基
3-(三氟甲基)-4-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-2-吡【口+井】基	3-甲氧基-2-吡【口+井】基
3-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	3-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
5-甲基-2-吡【口+井】基	5-甲氧基-2-吡【口+井】基
5-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	5-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
6-甲基-2-吡【口+井】基	6-甲氧基-2-吡【口+井】基
6-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	6-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
4-甲基-2-嘧啶基	4-甲氧基-2-嘧啶基
4-(三氟甲基)-2-嘧啶基	4-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
5-甲基-2-嘧啶基	5-甲氧基-2-嘧啶基

5-(三氟甲基)-2-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
2-甲基-4-嘧啶基	2-甲氧基-4-嘧啶基
2-(三氟甲基)-4-嘧啶基	2-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
5-甲基-4-嘧啶基	5-甲氧基-4-嘧啶基
5-(三氟甲基)-4-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
6-甲基-4-嘧啶基	6-甲氧基-4-嘧啶基
6-(三氟甲基)-4-嘧啶基	6-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
3-甲基-1-吡啶基	3-甲氧基-1-吡啶基
3-(三氟甲基)-1-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-1-吡啶基
4-甲基-1-吡啶基	4-甲氧基-1-吡啶基
4-(三氟甲基)-1-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-1-吡啶基
5-甲基-1-吡啶基	5-甲氧基-1-吡啶基
5-(三氟甲基)-1-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-1-吡啶基
4-甲基-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-甲氧基-1,2,3-三【口+井】-2-基
4-(三氟甲基)-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-三【口+井】-2-基
6-(2-嘧啶基)-2-吡啶基	2-(2-吡啶基)-4-噻唑基
2-(2-噻唑基)-4-噻唑基	2-(2-嘧啶基)乙炔基
1,3,4-【口+号】二唑-2-基	四氫-3-咪喃基
四氫-2-咪喃基	4,5-二氫-3-異【口+号】唑基
3-異【口+号】唑基	苯基
2-(三氟甲基)苯基	3-(三氟甲基)苯基
4-(三氟甲基)苯基	6-(三氟甲基)-3-吡【口+井】基

## A 為 CF

R	R
3-甲基-2-吡啶基	3-甲氧基-2-吡啶基
3-(三氟甲基)-2-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
4-甲基-2-吡啶基	4-甲氧基-2-吡啶基
4-(三氟甲基)-2-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
5-甲基-2-吡啶基	5-甲氧基-2-吡啶基
5-(三氟甲基)-2-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
6-甲基-2-吡啶基	6-甲氧基-2-吡啶基
6-(三氟甲基)-2-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
2-甲基-3-吡啶基	2-甲氧基-3-吡啶基
2-(三氟甲基)-3-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
4-甲基-3-吡啶基	4-甲氧基-3-吡啶基
4-(三氟甲基)-3-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
5-甲基-3-吡啶基	5-甲氧基-3-吡啶基
5-(三氟甲基)-3-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
6-甲基-3-吡啶基	6-甲氧基-3-吡啶基
6-(三氟甲基)-3-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
2-甲基-4-吡啶基	2-甲氧基-4-吡啶基

2-(三氟甲基)-4-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-4-吡啶基	3-甲氧基-4-吡啶基
3-(三氟甲基)-4-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-2-吡【口+井】基	3-甲氧基-2-吡【口+井】基
3-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	3-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
5-甲基-2-吡【口+井】基	5-甲氧基-2-吡【口+井】基
5-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	5-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
6-甲基-2-吡【口+井】基	6-甲氧基-2-吡【口+井】基
6-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	6-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
4-甲基-2-嘧啶基	4-甲氧基-2-嘧啶基
4-(三氟甲基)-2-嘧啶基	4-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
5-甲基-2-嘧啶基	5-甲氧基-2-嘧啶基
5-(三氟甲基)-2-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
2-甲基-4-嘧啶基	2-甲氧基-4-嘧啶基
2-(三氟甲基)-4-嘧啶基	2-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
5-甲基-4-嘧啶基	5-甲氧基-4-嘧啶基
5-(三氟甲基)-4-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
6-甲基-4-嘧啶基	6-甲氧基-4-嘧啶基
6-(三氟甲基)-4-嘧啶基	6-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
3-甲基-1-吡唑基	3-甲氧基-1-吡唑基
3-(三氟甲基)-1-吡唑基	3-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1-吡唑基	4-甲氧基-1-吡唑基
4-(三氟甲基)-1-吡唑基	4-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
5-甲基-1-吡唑基	5-甲氧基-1-吡唑基
5-(三氟甲基)-1-吡唑基	5-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-甲氧基-1,2,3-三【口+井】-2-基
4-(三氟甲基)-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-三【口+井】-2-基
6-(2-嘧啶基)-2-吡啶基	2-(2-吡啶基)-4-噻唑基
2-(2-噻唑基)-4-噻唑基	2-(2-嘧啶基)乙炔基
1,3,4-【口+号】二唑-2-基	四氫-3-咪喃基
四氫-2-咪喃基	4,5-二氫-3-異【口+号】唑基
3-異【口+号】唑基	苯基
2-(三氟甲基)苯基	3-(三氟甲基)苯基
4-(三氟甲基)苯基	6-(三氟甲基)-3-吡【口+井】基

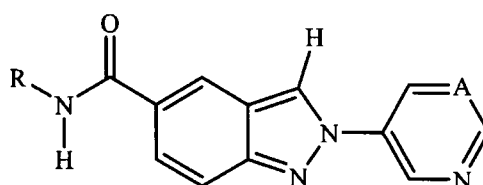
## A 為 N

R	R
3-甲基-2-吡啶基	3-甲氧基-2-吡啶基
3-(三氟甲基)-2-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
4-甲基-2-吡啶基	4-甲氧基-2-吡啶基
4-(三氟甲基)-2-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-2-吡啶基

5-甲基-2-吡啶基	5-甲氧基-2-吡啶基
5-(三氟甲基)-2-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
6-甲基-2-吡啶基	6-甲氧基-2-吡啶基
6-(三氟甲基)-2-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
2-甲基-3-吡啶基	2-甲氧基-3-吡啶基
2-(三氟甲基)-3-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
4-甲基-3-吡啶基	4-甲氧基-3-吡啶基
4-(三氟甲基)-3-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
5-甲基-3-吡啶基	5-甲氧基-3-吡啶基
5-(三氟甲基)-3-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
6-甲基-3-吡啶基	6-甲氧基-3-吡啶基
6-(三氟甲基)-3-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
2-甲基-4-吡啶基	2-甲氧基-4-吡啶基
2-(三氟甲基)-4-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-4-吡啶基	3-甲氧基-4-吡啶基
3-(三氟甲基)-4-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-2-吡【口+井】基	3-甲氧基-2-吡【口+井】基
3-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	3-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
5-甲基-2-吡【口+井】基	5-甲氧基-2-吡【口+井】基
5-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	5-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
6-甲基-2-吡【口+井】基	6-甲氧基-2-吡【口+井】基
6-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	6-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
4-甲基-2-嘧啶基	4-甲氧基-2-嘧啶基
4-(三氟甲基)-2-嘧啶基	4-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
5-甲基-2-嘧啶基	5-甲氧基-2-嘧啶基
5-(三氟甲基)-2-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
2-甲基-4-嘧啶基	2-甲氧基-4-嘧啶基
2-(三氟甲基)-4-嘧啶基	2-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
5-甲基-4-嘧啶基	5-甲氧基-4-嘧啶基
5-(三氟甲基)-4-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
6-甲基-4-嘧啶基	6-甲氧基-4-嘧啶基
6-(三氟甲基)-4-嘧啶基	6-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
3-甲基-1-吡唑基	3-甲氧基-1-吡唑基
3-(三氟甲基)-1-吡唑基	3-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1-吡唑基	4-甲氧基-1-吡唑基
4-(三氟甲基)-1-吡唑基	4-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
5-甲基-1-吡唑基	5-甲氧基-1-吡唑基
5-(三氟甲基)-1-吡唑基	5-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-甲氧基-1,2,3-三【口+井】-2-基
4-(三氟甲基)-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-三【口+井】-2-基

6-(2-嘧啶基)-2-吡啶基	2-(2-吡啶基)-4-噻唑基
2-(2-噻唑基)-4-噻唑基	2-(2-嘧啶基)乙炔基
1,3,4-【口+号】二唑-2-基	四氫-3-咪喃基
四氫-2-咪喃基	4,5-二氫-3-異【口+号】唑基
3-異【口+号】唑基	苯基
2-(三氟甲基)苯基	3-(三氟甲基)苯基
4-(三氟甲基)苯基	6-(三氟甲基)-3-吡【口+井】基

表 2a



A 為 CH

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH <sub>2</sub> Ph	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> C≡CH	-C(Me) <sub>2</sub> C≡CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F
-CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(Me)CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(i-Pr)CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe
-CH <sub>2</sub> OEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O(i-Pr)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe	-CH(Et)CH <sub>2</sub> OMe
-CH(Me)CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Et	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)(t-Bu)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(t-Bu)
-CH(Me)CH <sub>2</sub> SMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> (t-Bu)	-CH(Me)CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me
-CH(Me)CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN
-C(Me) <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(i-Pr) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me) <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	c-Pr	c-Bu
1-甲環丙基	3-甲氧基環丁基	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-硫坦基(3-thietanyl)	3,3-二氟環丁基
3-氧雜環丁烷基	-CH <sub>2</sub> (環氧乙烷基)	3-硫坦基-1,1-二氧
3-硫坦基-1-氧	-CH <sub>2</sub> (CH(-OC(Me) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -))	-CH <sub>2</sub> (四氫-2-咪喃基)
-CH <sub>2</sub> (2-咪喃基)	四氫-2-咪喃基	-CH <sub>2</sub> (2-噻吩基)
-CH <sub>2</sub> (CH(-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-))	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> (2,2-二氟環丙基)
-C(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)CO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)CO <sub>2</sub> Et	-CH(i-Pr)CO <sub>2</sub> Me

-CH <sub>2</sub> C(O)NHMe	-CH <sub>2</sub> C(O)NMe <sub>2</sub>	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe <sub>2</sub>
-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO <sub>2</sub> Me	-NHC(O)(3-吡啶基)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-己基)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-噻吩基)	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
-NHC(O)CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> Et	-NHC(O)(2-咪唑基)
-C(O)C(O)Me	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-C(O)CO <sub>2</sub> Me
-C(O)(2-吡啶基)	-NHC(O)NMe <sub>2</sub>	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NH(2-吡啶基)	-NH(3-吡啶基)
-NH(4-吡啶基)	-NH(2-噻吩基)	-NH(4-噻吩基)
-NH(5-噻吩基)	-NH(6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-NH(6-甲基-2-吡啶基)	-NH(4-甲基-2-吡啶基)
-NH(3-甲基-2-吡啶基)	-NH(5-甲基-2-噻吩基)	-NH(5-甲基-2-吡啶基)
-NH(4-甲基-2-噻吩基)	-NH(6-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(4-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(3-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(5-甲氧基-2-噻吩基)	-NH(5-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(4-甲氧基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (5-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (6-溴-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (3-(OCF <sub>3</sub> )苯基)	-CH <sub>2</sub> (2-噻唑基)
-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡【口+井】基)	-CH <sub>2</sub> (4-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
Ph	3-吡啶基	-CH <sub>2</sub> (3-吡啶基)
2-吡啶基	2-吡【口+井】基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
4-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基	6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基
5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	5-CF <sub>3</sub> -2-吡【口+井】基	5-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(-C(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(O)-)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (1-咪唑基)	-CH(-C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
-CH <sub>2</sub> (4-噻吩基)	嗒【口+井】基	6-CF <sub>3</sub> -3-吡【口+井】基

A 為 CF

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)

Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH <sub>2</sub> Ph	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> C≡CH	-C(Me) <sub>2</sub> C≡CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F
-CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(Me)CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(i-Pr)CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe
-CH <sub>2</sub> OEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O(i-Pr)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe	-CH(Et)CH <sub>2</sub> OMe
-CH(Me)CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Et	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)(t-Bu)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(t-Bu)
-CH(Me)CH <sub>2</sub> SMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> (t-Bu)	-CH(Me)CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me
-CH(Me)CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN
-C(Me) <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(i-Pr) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me) <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	c-Pr	c-Bu
1-甲環丙基	3-甲氧基環丁基	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-硫坦基(3-thietanyl)	3,3-二氟環丁基
3-氧雜環丁烷基	-CH <sub>2</sub> (環氧乙烷基)	3-硫坦基-1,1-二氧
3-硫坦基-1-氧	-CH <sub>2</sub> (CH(-OC(Me) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -))	-CH <sub>2</sub> (四氫-2-咪喃基)
-CH <sub>2</sub> (2-咪喃基)	四氫-2-咪喃基	-CH <sub>2</sub> (2-噻吩基)
-CH <sub>2</sub> (CH(-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-))	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> (2,2-二氟環丙基)
-C(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)CO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)CO <sub>2</sub> Et	-CH(i-Pr)CO <sub>2</sub> Me
-CH <sub>2</sub> C(O)NHMe	-CH <sub>2</sub> C(O)NMe <sub>2</sub>	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe <sub>2</sub>
-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO <sub>2</sub> Me	-NHC(O)(3-吡啶基)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-己基)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-噻吩基)	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
-NHC(O)CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> Et	-NHC(O)(2-咪喃基)
-C(O)C(O)Me	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-C(O)CO <sub>2</sub> Me
-C(O)(2-吡啶基)	-NHC(O)NMe <sub>2</sub>	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NH(2-吡啶基)	-NH(3-吡啶基)
-NH(4-吡啶基)	-NH(2-噻吩基)	-NH(4-噻吩基)
-NH(5-噻吩基)	-NH(6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-NH(6-甲基-2-吡啶基)	-NH(4-甲基-2-吡啶基)
-NH(3-甲基-2-吡啶基)	-NH(5-甲基-2-噻吩基)	-NH(5-甲基-2-吡啶基)
-NH(4-甲基-2-噻吩基)	-NH(6-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(4-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(3-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(5-甲氧基-2-噻吩基)	-NH(5-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(4-甲氧基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡啶基)

-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-溴-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (3-(OCF <sub>3</sub> )苯基)	-CH <sub>2</sub> (2-噻唑基)
-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡【□+井】基)	-CH <sub>2</sub> (4-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
Ph	3-吡啶基	-CH <sub>2</sub> (3-吡啶基)
2-吡啶基	2-吡【□+井】基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
4-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基	6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基
5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	5-CF <sub>3</sub> -2-吡【□+井】基	5-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(-C(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(O)-)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (1-咪唑基)	-CH(-C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
-CH <sub>2</sub> (4-嘧啶基)	嗒【□+井】基	6-CF <sub>3</sub> -3-吡【□+井】基

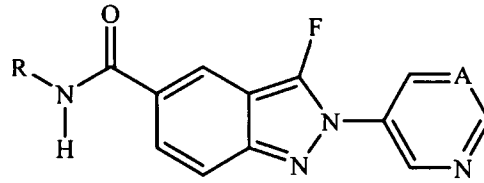
## A 為 N

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH <sub>2</sub> Ph	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> C≡CH	-C(Me) <sub>2</sub> C≡CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F
-CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(Me)CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(i-Pr)CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe
-CH <sub>2</sub> OEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O(i-Pr)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe	-CH(Et)CH <sub>2</sub> OMe
-CH(Me)CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Et	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)(t-Bu)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(t-Bu)
-CH(Me)CH <sub>2</sub> SMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> (t-Bu)	-CH(Me)CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me
-CH(Me)CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN
-C(Me) <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(i-Pr) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me) <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	c-Pr	c-Bu
1-甲環丙基	3-甲氧基環丁基	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-硫坦基(3-thietanyl)	3,3-二氟環丁基
3-氧雜環丁烷基	-CH <sub>2</sub> (環氧乙烷基)	3-硫坦基-1,1-二氧
3-硫坦基-1-氧	-CH <sub>2</sub> (CH(-OC(Me) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -))	-CH <sub>2</sub> (四氫-2-咪喃基)
-CH <sub>2</sub> (2-咪喃基)	四氫-2-咪喃基	-CH <sub>2</sub> (2-噻吩基)
-CH <sub>2</sub> (CH(-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-))	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> (2,2-二氟環丙基)
-C(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)CO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)CO <sub>2</sub> Et	-CH(i-Pr)CO <sub>2</sub> Me
-CH <sub>2</sub> C(O)NHMe	-CH <sub>2</sub> C(O)NMe <sub>2</sub>	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe <sub>2</sub>



-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO <sub>2</sub> Me	-NHC(O)(3-吡啶基)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-己基)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-噻吩基)	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
-NHC(O)CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> Et	-NHC(O)(2-咪唑基)
-C(O)C(O)Me	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-C(O)CO <sub>2</sub> Me
-C(O)(2-吡啶基)	-NHC(O)NMe <sub>2</sub>	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NH(2-吡啶基)	-NH(3-吡啶基)
-NH(4-吡啶基)	-NH(2-噻啶基)	-NH(4-噻啶基)
-NH(5-噻啶基)	-NH(6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-NH(6-甲基-2-吡啶基)	-NH(4-甲基-2-吡啶基)
-NH(3-甲基-2-吡啶基)	-NH(5-甲基-2-噻啶基)	-NH(5-甲基-2-吡啶基)
-NH(4-甲基-2-噻啶基)	-NH(6-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(4-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(3-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(5-甲氧基-2-噻啶基)	-NH(5-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(4-甲氧基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-溴-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (2-噻啶基)	-CH <sub>2</sub> (3-(OCF <sub>3</sub> )苯基)	-CH <sub>2</sub> (2-噻唑基)
-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡【口+井】基)	-CH <sub>2</sub> (4-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
Ph	3-吡啶基	-CH <sub>2</sub> (3-吡啶基)
2-吡啶基	2-吡【口+井】基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
4-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基	6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基
5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	5-CF <sub>3</sub> -2-吡【口+井】基	5-CF <sub>3</sub> -2-噻啶基
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(-C(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(O)-)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (1-咪唑基)	-CH(-C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
-CH <sub>2</sub> (4-噻啶基)	嗒【口+井】基	6-CF <sub>3</sub> -3-吡【口+井】基

表 2b



A 為 CH

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH <sub>2</sub> Ph	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> C≡CH	-C(Me) <sub>2</sub> C≡CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F
-CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(Me)CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(i-Pr)CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe
-CH <sub>2</sub> OEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O(i-Pr)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe	-CH(Et)CH <sub>2</sub> OMe
-CH(Me)CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Et	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)(t-Bu)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(t-Bu)
-CH(Me)CH <sub>2</sub> SMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> (t-Bu)	-CH(Me)CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me
-CH(Me)CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN
-C(Me) <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(i-Pr) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me) <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	c-Pr	c-Bu
1-甲環丙基	3-甲氧基環丁基	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-硫坦基(3-thietanyl)	3,3-二氟環丁基
3-氧雜環丁烷基	-CH <sub>2</sub> (環氧乙烷基)	3-硫坦基-1,1-二氧
3-硫坦基-1-氧	-CH <sub>2</sub> (CH(-OC(Me) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -))	-CH <sub>2</sub> (四氫-2-咪喃基)
-CH <sub>2</sub> (2-咪喃基)	四氫-2-咪喃基	-CH <sub>2</sub> (2-噻吩基)
-CH <sub>2</sub> (CH(-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-))	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> (2,2-二氟環丙基)
-C(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)CO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)CO <sub>2</sub> Et	-CH(i-Pr)CO <sub>2</sub> Me
-CH <sub>2</sub> C(O)NHMe	-CH <sub>2</sub> C(O)NMe <sub>2</sub>	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe <sub>2</sub>
-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO <sub>2</sub> Me	-NHC(O)(3-吡啶基)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-己基)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-噻吩基)	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
-NHC(O)CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> Et	-NHC(O)(2-咪喃基)
-C(O)C(O)Me	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-C(O)CO <sub>2</sub> Me

-C(O)(2-吡啶基)	-NHC(O)NMe <sub>2</sub>	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHSO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-NHSO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NH(2-吡啶基)	-NH(3-吡啶基)
-NH(4-吡啶基)	-NH(2-嘧啶基)	-NH(4-嘧啶基)
-NH(5-嘧啶基)	-NH(6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基)	-NH(6-甲基-2-吡啶基)	-NH(4-甲基-2-吡啶基)
-NH(3-甲基-2-吡啶基)	-NH(5-甲基-2-嘧啶基)	-NH(5-甲基-2-吡啶基)
-NH(4-甲基-2-嘧啶基)	-NH(6-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(4-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(3-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(5-甲氧基-2-嘧啶基)	-NH(5-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(4-甲氧基-2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (6-溴-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (2-嘧啶基)	-CH <sub>2</sub> (3-(OCF <sub>3</sub> )苯基)	-CH <sub>2</sub> (2-噻唑基)
-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡【□+井】基)	-CH <sub>2</sub> (4-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
Ph	3-吡啶基	-CH <sub>2</sub> (3-吡啶基)
2-吡啶基	2-吡【□+井】基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
4-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基	6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基
5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	5-CF <sub>3</sub> -2-吡【□+井】基	5-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(-C(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(O)-)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (1-咪唑基)	-CH(-C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
-CH <sub>2</sub> (4-嘧啶基)	嗒【□+井】基	6-CF <sub>3</sub> -3-吡【□+井】基

## A 為 CF

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH <sub>2</sub> Ph	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> C≡CH	-C(Me) <sub>2</sub> C≡CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F
-CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(Me)CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(i-Pr)CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe
-CH <sub>2</sub> OEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O(i-Pr)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe	-CH(Et)CH <sub>2</sub> OMe
-CH(Me)CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe

-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Et	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)(t-Bu)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(t-Bu)
-CH(Me)CH <sub>2</sub> SMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> (t-Bu)	-CH(Me)CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me
-CH(Me)CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN
-C(Me) <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(i-Pr) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me) <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	c-Pr	c-Bu
1-甲環丙基	3-甲氧基環丁基	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-硫坦基(3-thietanyl)	3,3-二氟環丁基
3-氧雜環丁烷基	-CH <sub>2</sub> (環氧乙烷基)	3-硫坦基-1,1-二氧
3-硫坦基-1-氧	-CH <sub>2</sub> (CH(-OC(Me) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -))	-CH <sub>2</sub> (四氫-2-咪喃基)
-CH <sub>2</sub> (2-咪喃基)	四氫-2-咪喃基	-CH <sub>2</sub> (2-噻吩基)
-CH <sub>2</sub> (CH(-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-))	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> (2,2-二氟環丙基)
-C(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)CO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)CO <sub>2</sub> Et	-CH(i-Pr)CO <sub>2</sub> Me
-CH <sub>2</sub> C(O)NHMe	-CH <sub>2</sub> C(O)NMe <sub>2</sub>	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe <sub>2</sub>
-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO <sub>2</sub> Me	-NHC(O)(3-吡啶基)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-己基)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-噻吩基)	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
-NHC(O)CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> Et	-NHC(O)(2-咪喃基)
-C(O)C(O)Me	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-C(O)CO <sub>2</sub> Me
-C(O)(2-吡啶基)	-NHC(O)NMe <sub>2</sub>	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-NH(2-吡啶基)	-NH(3-吡啶基)
-NH(4-吡啶基)	-NH(2-噻吩基)	-NH(4-噻吩基)
-NH(5-噻吩基)	-NH(6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-NH(5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-NH(4-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-NH(6-甲基-2-吡啶基)	-NH(4-甲基-2-吡啶基)
-NH(3-甲基-2-吡啶基)	-NH(5-甲基-2-噻吩基)	-NH(5-甲基-2-吡啶基)
-NH(4-甲基-2-噻吩基)	-NH(6-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(4-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(3-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(5-甲氧基-2-噻吩基)	-NH(5-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(4-甲氧基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-CF <sub>3</sub> -2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (6-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (3-甲氧基-2-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (5-甲氧基-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (4-甲氧基-2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (5-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (6-溴-2-吡啶基)
-CH <sub>2</sub> (2-噻吩基)	-CH <sub>2</sub> (3-(OCF <sub>3</sub> )苯基)	-CH <sub>2</sub> (2-噻唑基)
-CH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡【口+井】基)	-CH <sub>2</sub> (4-吡啶基)	-CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)

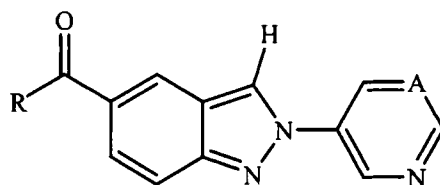
Ph	3-吡啶基	-CH <sub>2</sub> (3-吡啶基)
2-吡啶基	2-吡【口+井】基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
4-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (2-吡啶基)
3-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	4-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基	6-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基
5-CF <sub>3</sub> -2-吡啶基	5-CF <sub>3</sub> -2-吡【口+井】基	5-CF <sub>3</sub> -2-嘧啶基
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(-C(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(O)-)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (1-咪唑基)	-CH(-C(O)OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
-CH <sub>2</sub> (4-嘧啶基)	嗒【口+井】基	6-CF <sub>3</sub> -3-吡【口+井】基

## A 為 N

R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH <sub>2</sub> Ph	-CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> C≡CH	-C(Me) <sub>2</sub> C≡CH	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F
-CH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(Me)CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH(i-Pr)CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe
-CH <sub>2</sub> OEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O(i-Pr)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH(Me)OMe	-CH(Et)CH <sub>2</sub> OMe
-CH(Me)CH <sub>2</sub> OMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SEt	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Et
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)Et	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)(t-Bu)	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(t-Bu)
-CH(Me)CH <sub>2</sub> SMe	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> (t-Bu)	-CH(Me)CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me
-CH(Me)CH <sub>2</sub> S(O)Me	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(O)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN
-C(Me) <sub>2</sub> CN	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(i-Pr) <sub>2</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me) <sub>2</sub>
-CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	c-Pr	c-Bu
1-甲環丙基	3-甲氧基環丁基	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-硫坦基(3-thietanyl)	3,3-二氟環丁基
3-氧雜環丁烷基	-CH <sub>2</sub> (環氧乙烷基)	3-硫坦基-1,1-二氧
3-硫坦基-1-氧	-CH <sub>2</sub> (CH(-OC(Me) <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -))	-CH <sub>2</sub> (四氫-2-咪喃基)
-CH <sub>2</sub> (2-咪喃基)	四氫-2-咪喃基	-CH <sub>2</sub> (2-噻吩基)
-CH <sub>2</sub> (CH(-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-))	-CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	-CH <sub>2</sub> (2,2-二氟環丙基)
-C(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)CO <sub>2</sub> Me	-CH(Me)CO <sub>2</sub> Et	-CH(i-Pr)CO <sub>2</sub> Me
-CH <sub>2</sub> C(O)NHMe	-CH <sub>2</sub> C(O)NMe <sub>2</sub>	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH <sub>2</sub> (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe <sub>2</sub>
-OCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO <sub>2</sub> Me	-NHC(O)(3-吡啶基)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-己基)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-噻吩基)	-NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )
-NHC(O)CF <sub>3</sub>	-NHCO <sub>2</sub> Et	-NHC(O)(2-咪喃基)
-C(O)C(O)Me	-NHCO <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	-C(O)CO <sub>2</sub> Me

-C(O)(2-吡啶基)	-NHC(O)NMe2	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH2CF3	-NHC(O)CH2CH2CF3	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH2CF3	-NHSO2CF3	-NHSO2CH2CF3
-NHSO2CH2CH2CF3	-NH(2-吡啶基)	-NH(3-吡啶基)
-NH(4-吡啶基)	-NH(2-嘧啶基)	-NH(4-嘧啶基)
-NH(5-嘧啶基)	-NH(6-CF3-2-吡啶基)	-NH(4-CF3-2-吡啶基)
-NH(3-CF3-2-吡啶基)	-NH(5-CF3-2-嘧啶基)	-NH(5-CF3-2-吡啶基)
-NH(4-CF3-2-嘧啶基)	-NH(6-甲基-2-吡啶基)	-NH(4-甲基-2-吡啶基)
-NH(3-甲基-2-吡啶基)	-NH(5-甲基-2-嘧啶基)	-NH(5-甲基-2-吡啶基)
-NH(4-甲基-2-嘧啶基)	-NH(6-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(4-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(3-甲氧基-2-吡啶基)	-NH(5-甲氧基-2-嘧啶基)	-NH(5-甲氧基-2-吡啶基)
-NH(4-甲氧基-2-嘧啶基)	-CH2(6-CF3-2-吡啶基)	-CH2(4-CF3-2-吡啶基)
-CH2(3-CF3-2-吡啶基)	-CH2(5-CF3-2-嘧啶基)	-CH2(5-CF3-2-吡啶基)
-CH2(4-CF3-2-嘧啶基)	-CH2(6-甲基-2-吡啶基)	-CH2(4-甲基-2-吡啶基)
-CH2(3-甲基-2-吡啶基)	-CH2(5-甲基-2-嘧啶基)	-CH2(5-甲基-2-吡啶基)
-CH2(4-甲基-2-嘧啶基)	-CH2(6-甲氧基-2-吡啶基)	-CH2(4-甲氧基-2-吡啶基)
-CH2(3-甲氧基-2-吡啶基)	-CH2(5-甲氧基-2-嘧啶基)	-CH2(5-甲氧基-2-吡啶基)
-CH2(4-甲氧基-2-嘧啶基)	-CH2(5-嘧啶基)	-CH2(6-溴-2-吡啶基)
-CH2(2-嘧啶基)	-CH2(3-(OCF3)苯基)	-CH2(2-噻唑基)
-CH2(5-甲基-2-吡【□+井】基)	-CH2(4-吡啶基)	-CH2(2-吡啶基)
Ph	3-吡啶基	-CH2(3-吡啶基)
2-吡啶基	2-吡【□+井】基	-CH2CH2(2-吡啶基)
4-吡啶基	4-CF3-2-吡啶基	-CH2CH2CH2(2-吡啶基)
3-CF3-2-吡啶基	4-CF3-2-嘧啶基	6-CF3-2-吡啶基
5-CF3-2-吡啶基	5-CF3-2-吡【□+井】基	5-CF3-2-嘧啶基
-CH2CH2N(-C(O)CH2CH2C(O)-)	-CH2CH2CH2(1-咪唑基)	-CH(-C(O)OCH2CH2-)
-CH2(4-嘧啶基)	嗒【□+井】基	6-CF3-3-吡【□+井】基

表 2c



A 為 CH

R	R
N(-CH2CH2CH2-)	N(-CH2CH(OMe)CH2-)
N(-CH2CH2CF2CH2CH2-)	N(-CH2CH2CH2CF2CH2-)

N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C(O)(c-Pr))CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> N=CH-)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -)
N(CH <sub>2</sub> C≡CH) <sub>2</sub>	N(Et) <sub>2</sub>
N(Pr)CH <sub>2</sub> (c-Pr)	N(Et)(c-己基)
N(-CHC(O)SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	

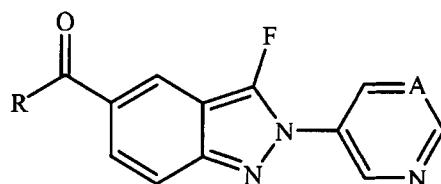
A 為 CF

R	R
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH(OMe)CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C(O)(c-Pr))CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> N=CH-)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -)
N(CH <sub>2</sub> C≡CH) <sub>2</sub>	N(Et) <sub>2</sub>
N(Pr)CH <sub>2</sub> (c-Pr)	N(Et)(c-己基)
N(-CHC(O)SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	

A 為 N

R	R
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH(OMe)CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C(O)(c-Pr))CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> N=CH-)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -)
N(CH <sub>2</sub> C≡CH) <sub>2</sub>	N(Et) <sub>2</sub>
N(Pr)CH <sub>2</sub> (c-Pr)	N(Et)(c-己基)
N(-CHC(O)SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	

表 2d



## A 為 CH

R	R
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH(OMe)CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C(O)(c-Pr))CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> N=CH-)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -)
N(CH <sub>2</sub> C≡CH) <sub>2</sub>	N(Et) <sub>2</sub>
N(Pr)CH <sub>2</sub> (c-Pr)	N(Et)(c-己基)
N(-CHC(O)SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	

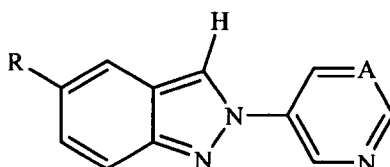
## A 為 CF

R	R
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH(OMe)CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C(O)(c-Pr))CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> N=CH-)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -)
N(CH <sub>2</sub> C≡CH) <sub>2</sub>	N(Et) <sub>2</sub>
N(Pr)CH <sub>2</sub> (c-Pr)	N(Et)(c-己基)
N(-CHC(O)SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	

## A 為 N

R	R
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH(OMe)CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C(O)(c-Pr))CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)
N(-CH <sub>2</sub> C(Me) <sub>2</sub> N=CH-)	N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> -)
N(CH <sub>2</sub> C≡CH) <sub>2</sub>	N(Et) <sub>2</sub>
N(Pr)CH <sub>2</sub> (c-Pr)	N(Et)(c-己基)
N(-CHC(O)SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	

表 2e





## A 為 CH

R	R
3-甲基-2-吡啶基	3-甲氧基-2-吡啶基
3-(三氟甲基)-2-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
4-甲基-2-吡啶基	4-甲氧基-2-吡啶基
4-(三氟甲基)-2-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
5-甲基-2-吡啶基	5-甲氧基-2-吡啶基
5-(三氟甲基)-2-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
6-甲基-2-吡啶基	6-甲氧基-2-吡啶基
6-(三氟甲基)-2-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
2-甲基-3-吡啶基	2-甲氧基-3-吡啶基
2-(三氟甲基)-3-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
4-甲基-3-吡啶基	4-甲氧基-3-吡啶基
4-(三氟甲基)-3-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
5-甲基-3-吡啶基	5-甲氧基-3-吡啶基
5-(三氟甲基)-3-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
6-甲基-3-吡啶基	6-甲氧基-3-吡啶基
6-(三氟甲基)-3-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
2-甲基-4-吡啶基	2-甲氧基-4-吡啶基
2-(三氟甲基)-4-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-4-吡啶基	3-甲氧基-4-吡啶基
3-(三氟甲基)-4-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-2-吡【□+井】基	3-甲氧基-2-吡【□+井】基
3-(三氟甲基)-2-吡【□+井】基	3-(CH(=NOMe))-2-吡【□+井】基
5-甲基-2-吡【□+井】基	5-甲氧基-2-吡【□+井】基
5-(三氟甲基)-2-吡【□+井】基	5-(CH(=NOMe))-2-吡【□+井】基
6-甲基-2-吡【□+井】基	6-甲氧基-2-吡【□+井】基
6-(三氟甲基)-2-吡【□+井】基	6-(CH(=NOMe))-2-吡【□+井】基
4-甲基-2-嘧啶基	4-甲氧基-2-嘧啶基
4-(三氟甲基)-2-嘧啶基	4-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
5-甲基-2-嘧啶基	5-甲氧基-2-嘧啶基
5-(三氟甲基)-2-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
2-甲基-4-嘧啶基	2-甲氧基-4-嘧啶基
2-(三氟甲基)-4-嘧啶基	2-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
5-甲基-4-嘧啶基	5-甲氧基-4-嘧啶基
5-(三氟甲基)-4-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
6-甲基-4-嘧啶基	6-甲氧基-4-嘧啶基
6-(三氟甲基)-4-嘧啶基	6-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
3-甲基-1-吡唑基	3-甲氧基-1-吡唑基
3-(三氟甲基)-1-吡唑基	3-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1-吡唑基	4-甲氧基-1-吡唑基
4-(三氟甲基)-1-吡唑基	4-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
5-甲基-1-吡唑基	5-甲氧基-1-吡唑基

5-(三氟甲基)-1-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-1-吡啶基
4-甲基-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-甲氧基-1,2,3-三【口+井】-2-基
4-(三氟甲基)-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-三【口+井】-2-基
6-(2-嘧啶基)-2-吡啶基	2-(2-吡啶基)-4-噻唑基
2-(2-噻唑基)-4-噻唑基	2-(2-嘧啶基)乙炔基
1,3,4-【口+号】二唑-2-基	四氫-3-咪喃基
四氫-2-咪喃基	4,5-二氫-3-異【口+号】唑基
3-異【口+号】唑基	6-(三氟甲基)-3-吡【口+井】基

## A 為 CF

R	R
3-甲基-2-吡啶基	3-甲氧基-2-吡啶基
3-(三氟甲基)-2-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
4-甲基-2-吡啶基	4-甲氧基-2-吡啶基
4-(三氟甲基)-2-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
5-甲基-2-吡啶基	5-甲氧基-2-吡啶基
5-(三氟甲基)-2-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
6-甲基-2-吡啶基	6-甲氧基-2-吡啶基
6-(三氟甲基)-2-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
2-甲基-3-吡啶基	2-甲氧基-3-吡啶基
2-(三氟甲基)-3-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
4-甲基-3-吡啶基	4-甲氧基-3-吡啶基
4-(三氟甲基)-3-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
5-甲基-3-吡啶基	5-甲氧基-3-吡啶基
5-(三氟甲基)-3-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
6-甲基-3-吡啶基	6-甲氧基-3-吡啶基
6-(三氟甲基)-3-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
2-甲基-4-吡啶基	2-甲氧基-4-吡啶基
2-(三氟甲基)-4-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-4-吡啶基	3-甲氧基-4-吡啶基
3-(三氟甲基)-4-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-2-吡【口+井】基	3-甲氧基-2-吡【口+井】基
3-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	3-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
5-甲基-2-吡【口+井】基	5-甲氧基-2-吡【口+井】基
5-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	5-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
6-甲基-2-吡【口+井】基	6-甲氧基-2-吡【口+井】基
6-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	6-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
4-甲基-2-嘧啶基	4-甲氧基-2-嘧啶基
4-(三氟甲基)-2-嘧啶基	4-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基

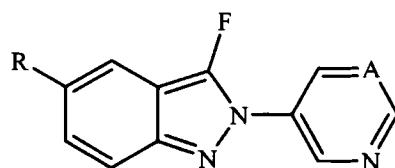
5-甲基-2-嘧啶基	5-甲氧基-2-嘧啶基
5-(三氟甲基)-2-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
2-甲基-4-嘧啶基	2-甲氧基-4-嘧啶基
2-(三氟甲基)-4-嘧啶基	2-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
5-甲基-4-嘧啶基	5-甲氧基-4-嘧啶基
5-(三氟甲基)-4-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
6-甲基-4-嘧啶基	6-甲氧基-4-嘧啶基
6-(三氟甲基)-4-嘧啶基	6-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
3-甲基-1-吡啶基	3-甲氧基-1-吡啶基
3-(三氟甲基)-1-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-1-吡啶基
4-甲基-1-吡啶基	4-甲氧基-1-吡啶基
4-(三氟甲基)-1-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-1-吡啶基
5-甲基-1-吡啶基	5-甲氧基-1-吡啶基
5-(三氟甲基)-1-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-1-吡啶基
4-甲基-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-甲氧基-1,2,3-三【口+井】-2-基
4-(三氟甲基)-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-三【口+井】-2-基
6-(2-嘧啶基)-2-吡啶基	2-(2-吡啶基)-4-噻唑基
2-(2-噻唑基)-4-噻唑基	2-(2-嘧啶基)乙炔基
1,3,4-【口+号】二唑-2-基	四氫-3-咪喃基
四氫-2-咪喃基	4,5-二氫-3-異【口+号】唑基
3-異【口+号】唑基	6-(三氟甲基)-3-吡【口+井】基

## A 為 N

R	R
3-甲基-2-吡啶基	3-甲氧基-2-吡啶基
3-(三氟甲基)-2-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
4-甲基-2-吡啶基	4-甲氧基-2-吡啶基
4-(三氟甲基)-2-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
5-甲基-2-吡啶基	5-甲氧基-2-吡啶基
5-(三氟甲基)-2-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
6-甲基-2-吡啶基	6-甲氧基-2-吡啶基
6-(三氟甲基)-2-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
2-甲基-3-吡啶基	2-甲氧基-3-吡啶基
2-(三氟甲基)-3-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
4-甲基-3-吡啶基	4-甲氧基-3-吡啶基
4-(三氟甲基)-3-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
5-甲基-3-吡啶基	5-甲氧基-3-吡啶基
5-(三氟甲基)-3-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
6-甲基-3-吡啶基	6-甲氧基-3-吡啶基
6-(三氟甲基)-3-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
2-甲基-4-吡啶基	2-甲氧基-4-吡啶基

2-(三氟甲基)-4-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-4-吡啶基	3-甲氧基-4-吡啶基
3-(三氟甲基)-4-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-2-吡【口+井】基	3-甲氧基-2-吡【口+井】基
3-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	3-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
5-甲基-2-吡【口+井】基	5-甲氧基-2-吡【口+井】基
5-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	5-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
6-甲基-2-吡【口+井】基	6-甲氧基-2-吡【口+井】基
6-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	6-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
4-甲基-2-嘧啶基	4-甲氧基-2-嘧啶基
4-(三氟甲基)-2-嘧啶基	4-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
5-甲基-2-嘧啶基	5-甲氧基-2-嘧啶基
5-(三氟甲基)-2-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
2-甲基-4-嘧啶基	2-甲氧基-4-嘧啶基
2-(三氟甲基)-4-嘧啶基	2-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
5-甲基-4-嘧啶基	5-甲氧基-4-嘧啶基
5-(三氟甲基)-4-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
6-甲基-4-嘧啶基	6-甲氧基-4-嘧啶基
6-(三氟甲基)-4-嘧啶基	6-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
3-甲基-1-吡唑基	3-甲氧基-1-吡唑基
3-(三氟甲基)-1-吡唑基	3-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1-吡唑基	4-甲氧基-1-吡唑基
4-(三氟甲基)-1-吡唑基	4-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
5-甲基-1-吡唑基	5-甲氧基-1-吡唑基
5-(三氟甲基)-1-吡唑基	5-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-甲氧基-1,2,3-三【口+井】-2-基
4-(三氟甲基)-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-三【口+井】-2-基
6-(2-嘧啶基)-2-吡啶基	2-(2-吡啶基)-4-噻唑基
2-(2-噻唑基)-4-噻唑基	2-(2-嘧啶基)乙炔基
1,3,4-【口+号】二唑-2-基	四氫-3-咪喃基
四氫-2-咪喃基	4,5-二氫-3-異【口+号】唑基
3-異【口+号】唑基	6-(三氟甲基)-3-吡【口+井】基

表 2f



## A 為 CH

R	R
3-甲基-2-吡啶基	3-甲氧基-2-吡啶基
3-(三氟甲基)-2-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
4-甲基-2-吡啶基	4-甲氧基-2-吡啶基
4-(三氟甲基)-2-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
5-甲基-2-吡啶基	5-甲氧基-2-吡啶基
5-(三氟甲基)-2-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
6-甲基-2-吡啶基	6-甲氧基-2-吡啶基
6-(三氟甲基)-2-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
2-甲基-3-吡啶基	2-甲氧基-3-吡啶基
2-(三氟甲基)-3-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
4-甲基-3-吡啶基	4-甲氧基-3-吡啶基
4-(三氟甲基)-3-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
5-甲基-3-吡啶基	5-甲氧基-3-吡啶基
5-(三氟甲基)-3-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
6-甲基-3-吡啶基	6-甲氧基-3-吡啶基
6-(三氟甲基)-3-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
2-甲基-4-吡啶基	2-甲氧基-4-吡啶基
2-(三氟甲基)-4-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-4-吡啶基	3-甲氧基-4-吡啶基
3-(三氟甲基)-4-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-2-吡【口+井】基	3-甲氧基-2-吡【口+井】基
3-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	3-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
5-甲基-2-吡【口+井】基	5-甲氧基-2-吡【口+井】基
5-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	5-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
6-甲基-2-吡【口+井】基	6-甲氧基-2-吡【口+井】基
6-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	6-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
4-甲基-2-嘧啶基	4-甲氧基-2-嘧啶基
4-(三氟甲基)-2-嘧啶基	4-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
5-甲基-2-嘧啶基	5-甲氧基-2-嘧啶基
5-(三氟甲基)-2-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
2-甲基-4-嘧啶基	2-甲氧基-4-嘧啶基
2-(三氟甲基)-4-嘧啶基	2-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
5-甲基-4-嘧啶基	5-甲氧基-4-嘧啶基
5-(三氟甲基)-4-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
6-甲基-4-嘧啶基	6-甲氧基-4-嘧啶基
6-(三氟甲基)-4-嘧啶基	6-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
3-甲基-1-吡唑基	3-甲氧基-1-吡唑基
3-(三氟甲基)-1-吡唑基	3-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1-吡唑基	4-甲氧基-1-吡唑基
4-(三氟甲基)-1-吡唑基	4-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
5-甲基-1-吡唑基	5-甲氧基-1-吡唑基

5-(三氟甲基)-1-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-1-吡啶基
4-甲基-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-甲氧基-1,2,3-三【口+井】-2-基
4-(三氟甲基)-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-三【口+井】-2-基
6-(2-嘧啶基)-2-吡啶基	2-(2-吡啶基)-4-噻唑基
2-(2-噻唑基)-4-噻唑基	2-(2-嘧啶基)乙炔基
1,3,4-【口+号】二唑-2-基	四氫-3-咪喃基
四氫-2-咪喃基	4,5-二氫-3-異【口+号】唑基
3-異【口+号】唑基	6-(三氟甲基)-3-吡【口+井】基

## A 為 CF

R	R
3-甲基-2-吡啶基	3-甲氧基-2-吡啶基
3-(三氟甲基)-2-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
4-甲基-2-吡啶基	4-甲氧基-2-吡啶基
4-(三氟甲基)-2-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
5-甲基-2-吡啶基	5-甲氧基-2-吡啶基
5-(三氟甲基)-2-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
6-甲基-2-吡啶基	6-甲氧基-2-吡啶基
6-(三氟甲基)-2-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
2-甲基-3-吡啶基	2-甲氧基-3-吡啶基
2-(三氟甲基)-3-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
4-甲基-3-吡啶基	4-甲氧基-3-吡啶基
4-(三氟甲基)-3-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
5-甲基-3-吡啶基	5-甲氧基-3-吡啶基
5-(三氟甲基)-3-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
6-甲基-3-吡啶基	6-甲氧基-3-吡啶基
6-(三氟甲基)-3-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
2-甲基-4-吡啶基	2-甲氧基-4-吡啶基
2-(三氟甲基)-4-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-4-吡啶基	3-甲氧基-4-吡啶基
3-(三氟甲基)-4-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-2-吡【口+井】基	3-甲氧基-2-吡【口+井】基
3-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	3-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
5-甲基-2-吡【口+井】基	5-甲氧基-2-吡【口+井】基
5-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	5-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
6-甲基-2-吡【口+井】基	6-甲氧基-2-吡【口+井】基
6-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	6-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
4-甲基-2-嘧啶基	4-甲氧基-2-嘧啶基
4-(三氟甲基)-2-嘧啶基	4-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
5-甲基-2-嘧啶基	5-甲氧基-2-嘧啶基
5-(三氟甲基)-2-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
2-甲基-4-嘧啶基	2-甲氧基-4-嘧啶基

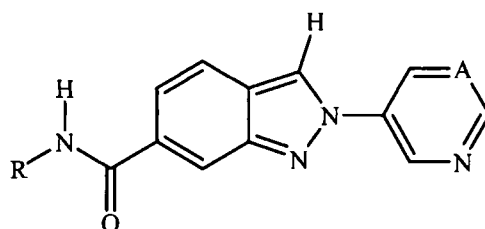
2-(三氟甲基)-4-嘧啶基	2-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
5-甲基-4-嘧啶基	5-甲氧基-4-嘧啶基
5-(三氟甲基)-4-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
6-甲基-4-嘧啶基	6-甲氧基-4-嘧啶基
6-(三氟甲基)-4-嘧啶基	6-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
3-甲基-1-吡唑基	3-甲氧基-1-吡唑基
3-(三氟甲基)-1-吡唑基	3-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1-吡唑基	4-甲氧基-1-吡唑基
4-(三氟甲基)-1-吡唑基	4-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
5-甲基-1-吡唑基	5-甲氧基-1-吡唑基
5-(三氟甲基)-1-吡唑基	5-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-甲氧基-1,2,3-三【口+井】-2-基
4-(三氟甲基)-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-三【口+井】-2-基
6-(2-嘧啶基)-2-吡啶基	2-(2-吡啶基)-4-噁唑基
2-(2-噁唑基)-4-噁唑基	2-(2-嘧啶基)乙炔基
1,3,4-【口+号】二唑-2-基	四氫-3-咪喃基
四氫-2-咪喃基	4,5-二氫-3-異【口+号】唑基
3-異【口+号】唑基	6-(三氟甲基)-3-吡【口+井】基

A 為 N

R	R
3-甲基-2-吡啶基	3-甲氧基-2-吡啶基
3-(三氟甲基)-2-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
4-甲基-2-吡啶基	4-甲氧基-2-吡啶基
4-(三氟甲基)-2-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
5-甲基-2-吡啶基	5-甲氧基-2-吡啶基
5-(三氟甲基)-2-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
6-甲基-2-吡啶基	6-甲氧基-2-吡啶基
6-(三氟甲基)-2-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-2-吡啶基
2-甲基-3-吡啶基	2-甲氧基-3-吡啶基
2-(三氟甲基)-3-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
4-甲基-3-吡啶基	4-甲氧基-3-吡啶基
4-(三氟甲基)-3-吡啶基	4-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
5-甲基-3-吡啶基	5-甲氧基-3-吡啶基
5-(三氟甲基)-3-吡啶基	5-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
6-甲基-3-吡啶基	6-甲氧基-3-吡啶基
6-(三氟甲基)-3-吡啶基	6-(CH(=NOMe))-3-吡啶基
2-甲基-4-吡啶基	2-甲氧基-4-吡啶基
2-(三氟甲基)-4-吡啶基	2-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-4-吡啶基	3-甲氧基-4-吡啶基
3-(三氟甲基)-4-吡啶基	3-(CH(=NOMe))-4-吡啶基
3-甲基-2-吡【口+井】基	3-甲氧基-2-吡【口+井】基

3-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	3-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
5-甲基-2-吡【口+井】基	5-甲氧基-2-吡【口+井】基
5-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	5-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
6-甲基-2-吡【口+井】基	6-甲氧基-2-吡【口+井】基
6-(三氟甲基)-2-吡【口+井】基	6-(CH(=NOMe))-2-吡【口+井】基
4-甲基-2-嘧啶基	4-甲氧基-2-嘧啶基
4-(三氟甲基)-2-嘧啶基	4-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
5-甲基-2-嘧啶基	5-甲氧基-2-嘧啶基
5-(三氟甲基)-2-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-2-嘧啶基
2-甲基-4-嘧啶基	2-甲氧基-4-嘧啶基
2-(三氟甲基)-4-嘧啶基	2-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
5-甲基-4-嘧啶基	5-甲氧基-4-嘧啶基
5-(三氟甲基)-4-嘧啶基	5-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
6-甲基-4-嘧啶基	6-甲氧基-4-嘧啶基
6-(三氟甲基)-4-嘧啶基	6-(CH(=NOMe))-4-嘧啶基
3-甲基-1-吡唑基	3-甲氧基-1-吡唑基
3-(三氟甲基)-1-吡唑基	3-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1-吡唑基	4-甲氧基-1-吡唑基
4-(三氟甲基)-1-吡唑基	4-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
5-甲基-1-吡唑基	5-甲氧基-1-吡唑基
5-(三氟甲基)-1-吡唑基	5-(CH(=NOMe))-1-吡唑基
4-甲基-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-甲氧基-1,2,3-三【口+井】-2-基
4-(三氟甲基)-1,2,3-三【口+井】-2-基	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-三【口+井】-2-基
6-(2-嘧啶基)-2-吡啶基	2-(2-吡啶基)-4-噁唑基
2-(2-噁唑基)-4-噁唑基	2-(2-嘧啶基)乙炔基
1,3,4-【口+罈】二唑-2-基	四氫-3-咪喃基
四氫-2-咪喃基	4,5-二氫-3-異【口+罈】唑基
3-異【口+罈】唑基	6-(三氟甲基)-3-吡【口+井】基

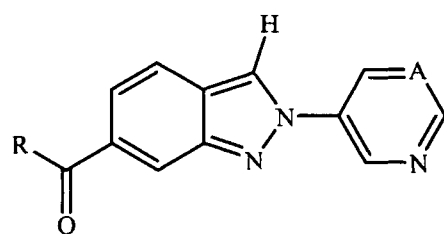
表 3a



【0179】 表 3a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

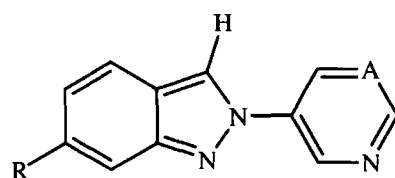


表 3c



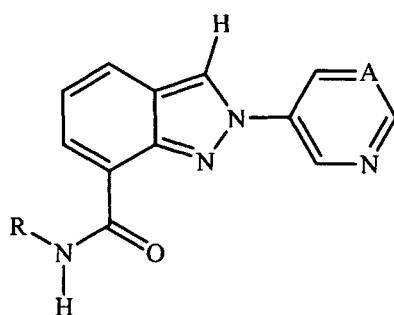
【0180】 表 3c 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 3e



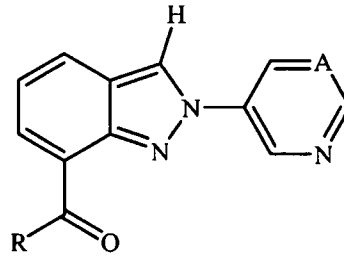
【0181】 表 3e 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 4a



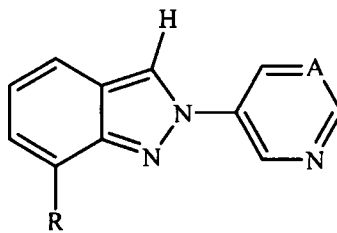
【0182】 表 4a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 4c



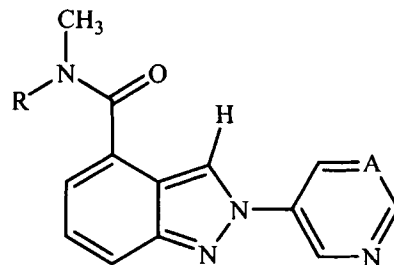
【0183】 表 4c 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 4e



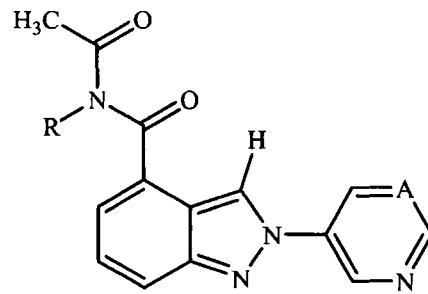
【0184】 表 4e 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 5a



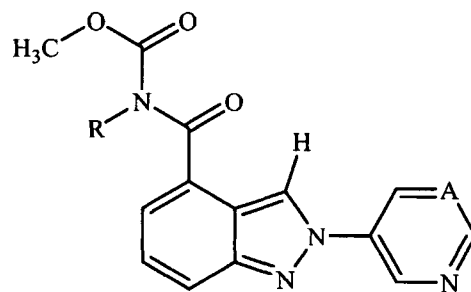
【0185】 表 5a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 5b



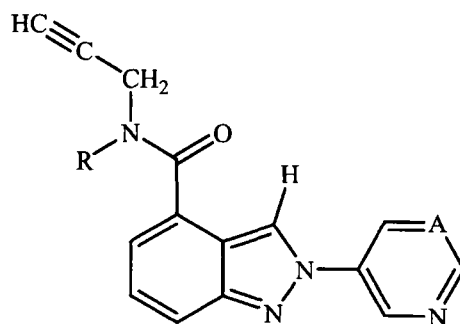
【0186】 表 5a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 5c



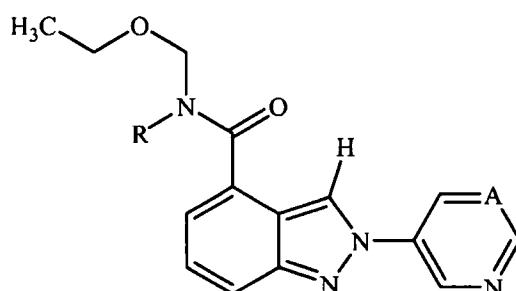
【0187】 表 5c 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 5d



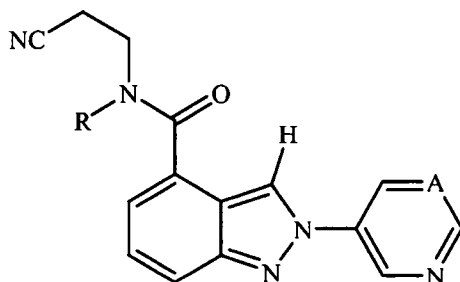
【0188】 表 5d 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 5e



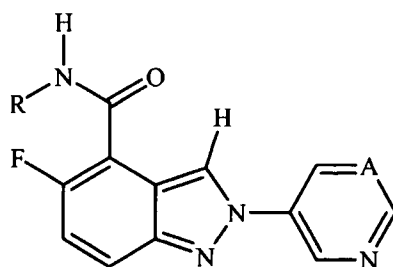
【0189】 表 5e 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 5f



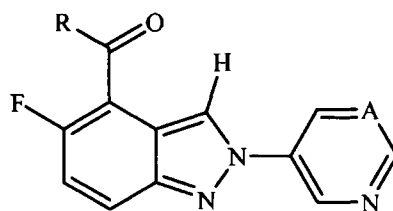
【0190】 表 5f 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 6a



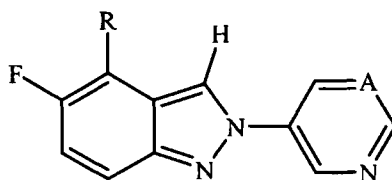
【0191】 表 6a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 6c



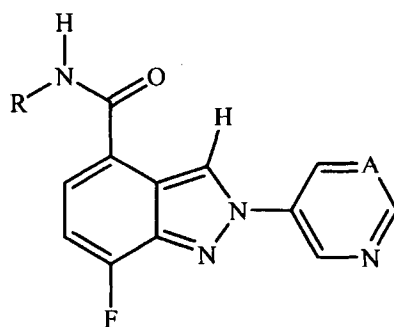
【0192】 表 6c 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 6e



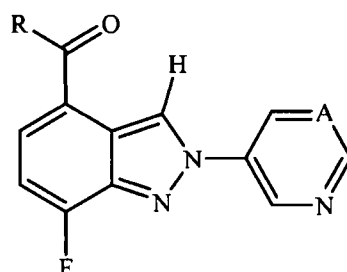
【0193】 表 6e 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 7a



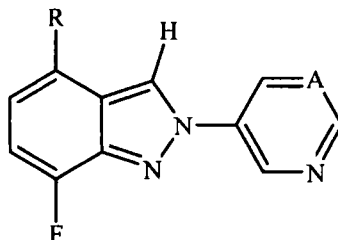
【0194】 表 7a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 7c



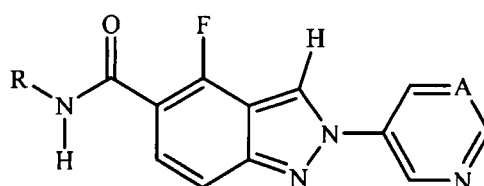
【0195】 表 7c 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 7e



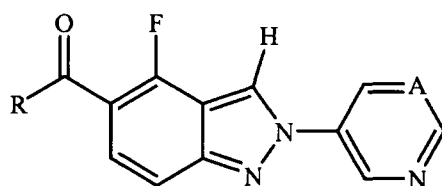
【0196】 表 7e 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 8a



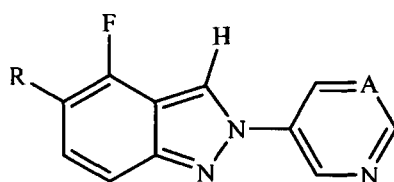
【0197】 表 8a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 8c



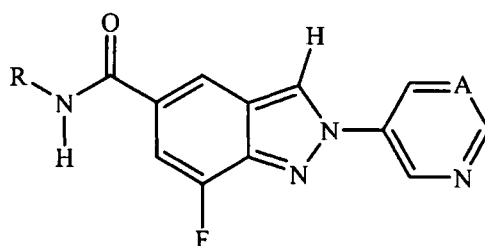
【0198】 表 8c 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 8e



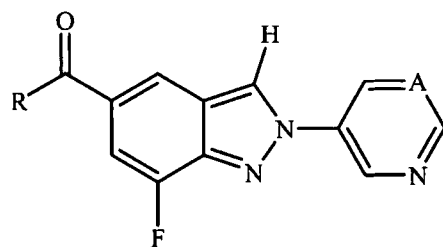
【0199】 表 8e 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 9a



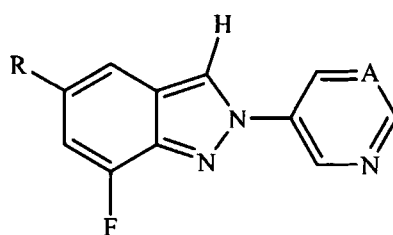
【0200】 表 9a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 9c



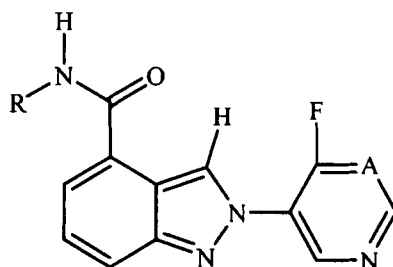
【0201】 表 9c 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 9e



【0202】 表 9e 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

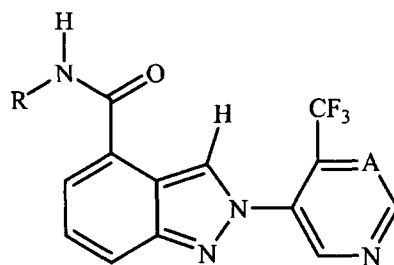
表 10a



【0203】 表 10a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

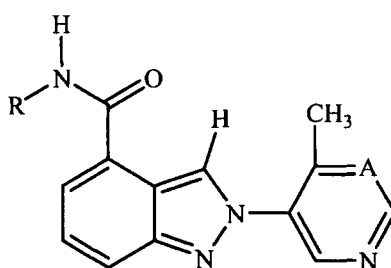


表 10b



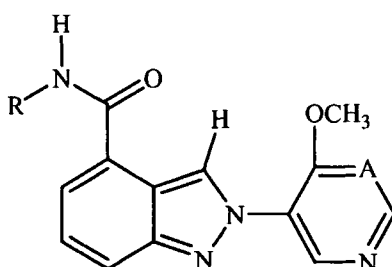
【0204】 表 10b 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 10c



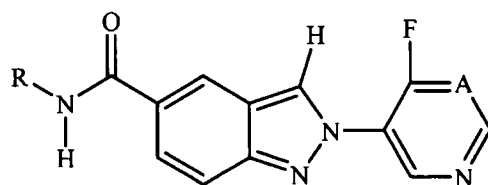
【0205】 表 10c 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 10d



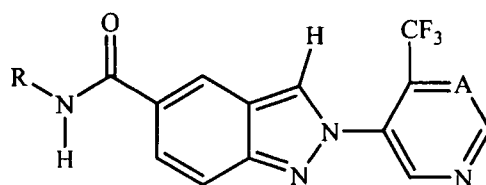
【0206】 表 10d 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 11a



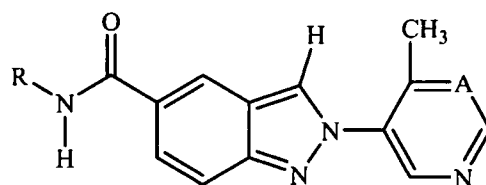
【0207】 表 11a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 11b



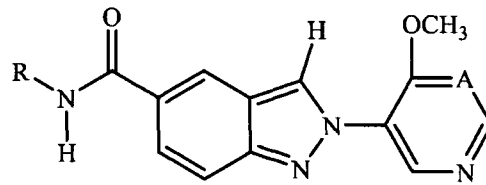
【0208】 表 11b 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 11c



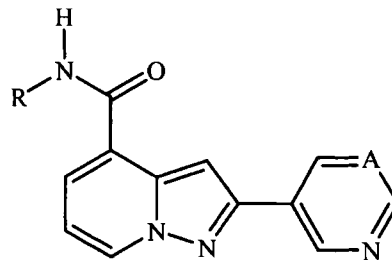
【0209】 表 11c 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 11d



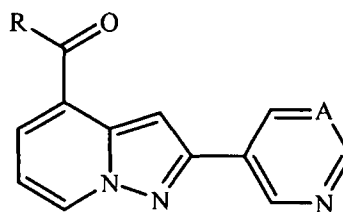
【0210】 表 11d 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 12a



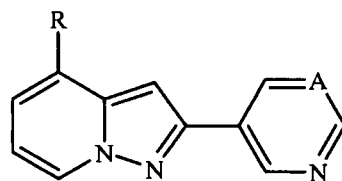
【0211】 表 12a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 12c



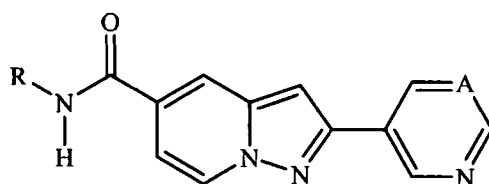
【0212】 表 12c 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 12e



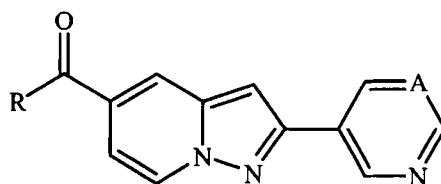
【0213】 表 12e 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 13a



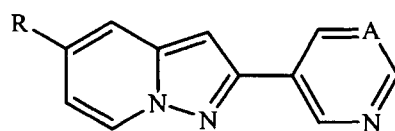
【0214】 表 13a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 13c



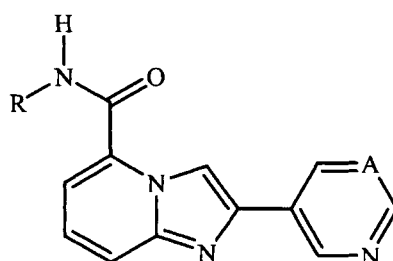
【0215】 表 13c 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 13e



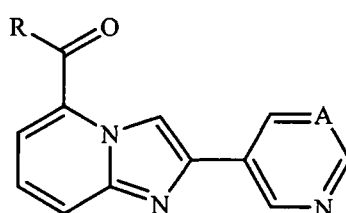
【0216】 表 13e 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 14a



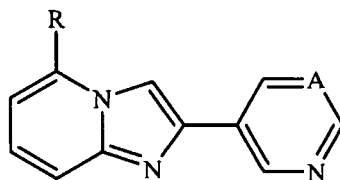
【0217】 表 14a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 14c



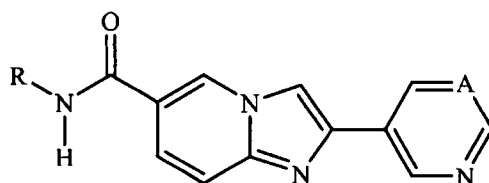
【0218】 表 14c 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 14e



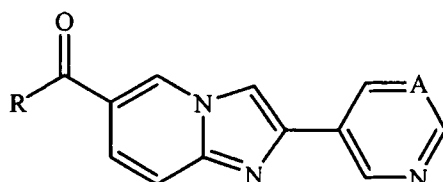
【0219】 表 14e 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 15a



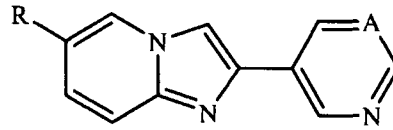
【0220】 表 15a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 15c



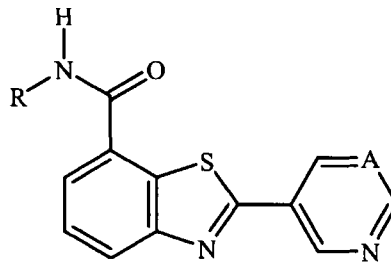
【0221】 表 15c 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 15e



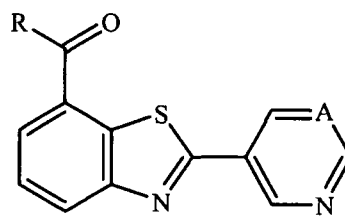
【0222】 表 15e 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 16a



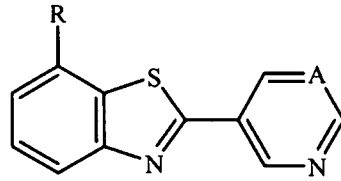
【0223】 表 16a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 16c



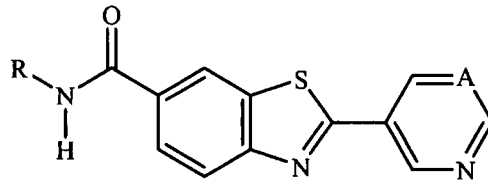
【0224】 表 16c 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 16e



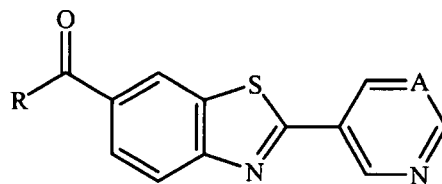
【0225】 表 16e 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 17a



【0226】 表 17a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

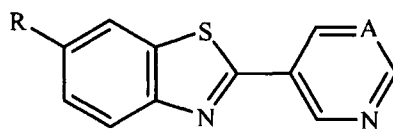
表 17c



【0227】 表 17c 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

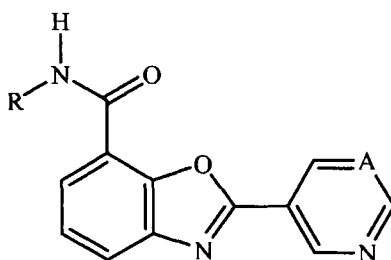


表 17e



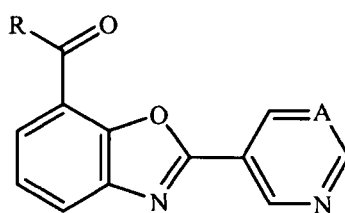
【0228】 表 17e 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 18a



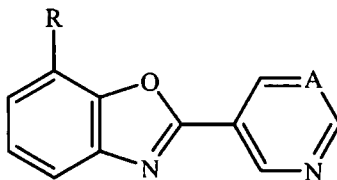
【0229】 表 18a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 18c



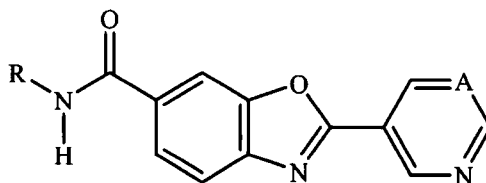
【0230】 表 18c 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 18e



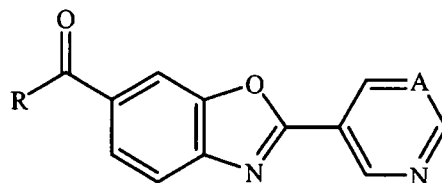
【0231】 表 18e 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 19a



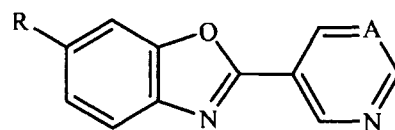
【0232】 表 19a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 19c



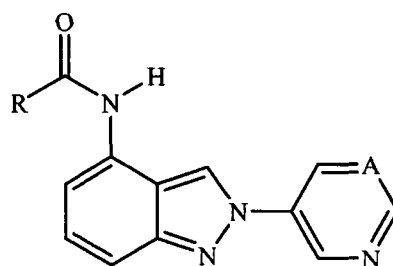
【0233】 表 19c 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 19e



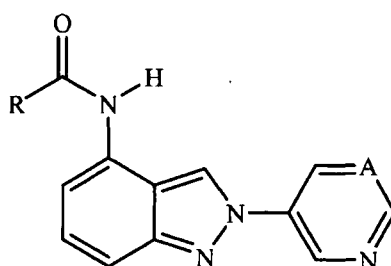
【0234】 表 19e 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 20a



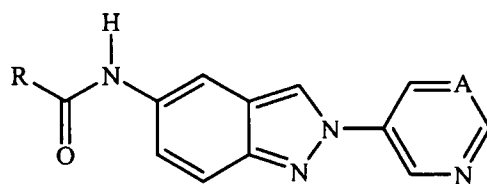
【0235】 表 20a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 20b



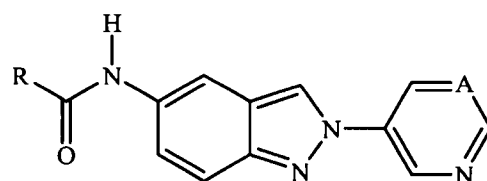
【0236】 表 20b 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 21a



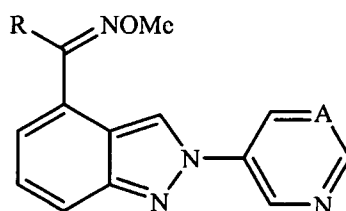
【0237】 表 21a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 21b



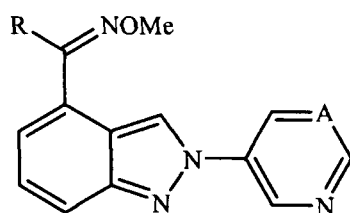
【0238】 表 21b 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 22a



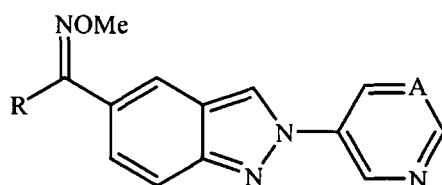
【0239】 表 22a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 22b



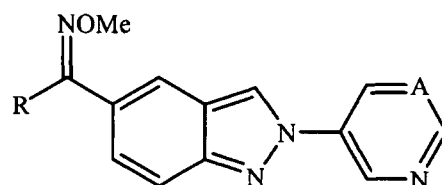
【0240】 表 22b 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 23a



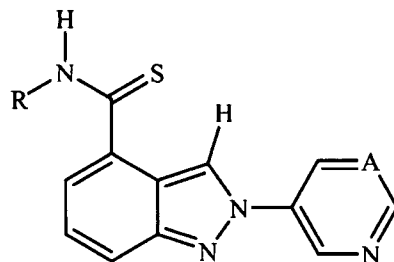
【0241】 表 23a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 23b



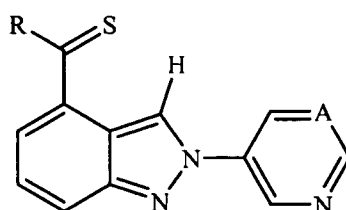
【0242】 表 23b 與表 1e 相同，除了標題「表 1e」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 24a



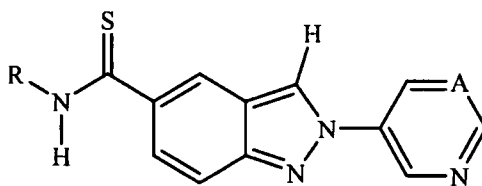
【0243】 表 24a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 24b



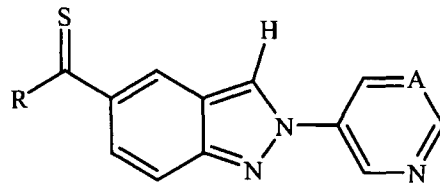
【0244】 表 24b 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 25a



【0245】 表 25a 與表 1a 相同，除了標題「表 1a」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

表 25b



【0246】 表 25b 與表 1c 相同，除了標題「表 1c」下方所示之結構係由以上所示之結構取代。

【0247】 本發明之化合物將通常用來作為組成物（即配方）中之防治無脊椎動物害蟲的活性成分，並伴隨有至少一選自由界面活性劑、固體稀釋劑及液體稀釋劑所組成之群組的額外組分以作為載體之用。此配方或組成物成分係經選擇，以配合活性成分之物理性質、施用型態與土壤種類、濕度和溫度等環境因素。

【0248】 可用的製劑包括液體及固體組成物。液體組成物包括溶液（包括可乳化濃縮物）、懸浮液、乳液（包括微乳液、水包油乳液、可流動濃縮物及/或濃懸乳液(suspoemulsion)）與類似者，並可選擇地將其增稠成凝膠。水性液體組成物的一般類型為可溶濃縮物(soluble concentrate)、懸浮濃縮物(suspension concentrate)、膠囊懸浮液(capsule suspension)、濃縮乳液、微乳液、水包油乳液、可流動濃縮物與濃懸乳液(suspoemulsion)。非水性液體組成物的一般類型為可乳化濃縮物、可微乳化濃縮物、可分散性濃縮物(dispersible concentrate)及油分散液(oil dispersion)。

【0249】 固體組成物的一般類型為塵粉(dust)、粉劑、粒劑、丸劑(pellet)、珠劑(prill)、錠劑(pastille)、片劑、包膜(filled film) (包括種子塗覆物) 與類似者，其可具有水分散性 (「可濕性」) 或水溶性。由成膜溶液或可流動懸浮液形成的膜和塗層在種子處理上特別有用。活性成分可經 (微) 膠囊化並進一步形成懸浮液或固體配方；或者整體活性成分配方可經囊封 (或「披覆」(overcoated))。囊封可以控制或延長活性成分之釋放。可乳化粒劑結合了可乳化濃縮物與乾粒狀配方的優點。高強度組成物主要用作進一步配方的中間物。

【0250】 通常在噴灑前會先將可噴灑配方在適合的介質中擴展。該液體及固體配方係調配為可隨時稀釋在噴灑介質中，通常為水，但有時為其他適當的介質，像是芳烴或石蠟烴或植物油。噴灑的量可從每公頃約一到數千公升，但更通常為從每公頃約十到數百公升。可噴灑配方可在桶中與水或其他適合介質混合，藉由空中或地面施用而運用於葉處理，或施用於植物的生長介質。液體配方與乾配方可在栽植時，直接計量加入滴流灌溉系統或犁溝。液體和固體配方可被施用到農作物之種子和其他所需植被，作為栽植前種子處理之用，透過系統性吸收以保護發育中的根及其它地下的植物部分及/或葉。

【0251】 該配方通常含有有效量的活性成分、稀釋劑和界面活性劑，其以重量計落於下列概略範圍中且加起來會等於百分之百。

	重量百分比		
	活性成分	稀釋劑	界面活性劑
水分散性及水溶性粒劑、片劑及粉劑	0.001-90	0-99.999	0-15



油分散液、懸浮液、乳液、溶液（包括可乳化濃縮物）	1-50	40-99	0-50
塵粉	1-25	70-99	0-5
粒劑與丸劑	0.001-99	5-99.999	0-15
高強度組成物	90-99	0-10	0-2

**【0252】** 固體稀釋劑包括例如，黏土如膨土、微晶高嶺石、厄帖浦石與高嶺土、石膏、纖維素、二氧化鈦、氧化鋅、澱粉、糊精、糖（例如乳糖、蔗糖）、二氧化矽、滑石、雲母、矽藻土、尿素、碳酸鈣、碳酸鈉、碳酸氫鈉及硫酸鈉。典型的固體稀釋劑係描述於 Watkins et al., *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey。

**【0253】** 液體稀釋劑例如包括水、*N,N*-二甲基烷醯胺（例如，*N,N*-二甲基甲醯胺）、萘烯、二甲亞砷、*N*-烷吡咯啉酮（例如，*N*-甲基吡咯啉酮）、烷基磷酸鹽類（例如，三乙基磷酸鹽）、乙二醇、三乙二醇、丙二醇、二丙烯甘醇、聚丙二醇、碳酸丙烯酯、碳酸丁二酯、石蠟（例如，白礦油、正構烷烴、異烷烴）、烷基苯、烷基萘、甘油、三乙酸甘油酯、山梨糖醇、芳香族碳氫化合物、脫芳脂族、烷基苯、烷基萘、酮如環己酮、2-庚酮、異佛酮與 4-羥基-4-甲基-2-戊酮、乙酸酯如乙酸異戊酯、乙酸己酯、乙酸庚酯、乙酸辛酯、乙酸壬酯、乙酸十三酯與乙酸異茨酯、其他酯類如烷化乳酸酯、二元酯類烷基與芳基苯甲酸酯、 $\gamma$ -丁內酯與醇類，其可為直鏈、支鏈、飽和或不飽和，諸如甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、正己醇、2-乙基己醇、正辛醇、癸醇、異癸醇、異十八醇、十六醇、月桂醇、十三醇、油醇、環己醇、四氫糠醇、二丙酮醇、甲酚與苻醇。液體稀

釋劑也包括飽和及不飽和脂肪酸的甘油酯（通常為 C<sub>6</sub>-C<sub>22</sub>），諸如植物種子與水果油（例如橄欖、蓖麻、亞麻仁、芝麻、玉米、花生、向日葵、葡萄籽、紅花、棉籽、黃豆、油菜籽、椰子與棕櫚仁的油）、動物源性脂肪（例如牛脂、豬肉脂、豬油、鱈魚肝油、魚油）及其混合物。液體稀釋劑也包括烷化脂肪酸（例如甲基化、乙基化、丁基化），其中該脂肪酸可藉由水解來自植物和動物來源的甘油酯而獲得，並可用蒸餾純化。典型的液體稀釋劑係描述於 Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950。

**【0254】** 本發明的固體和液體組成物通常包括一或多種界面活性劑。當加入至液體中時，界面活性劑（也稱為「表面活性劑」）通常會改變（最常見為減少）液體的表面張力。依據界面活性劑分子中親水性和親油性基團的性質，界面活性劑可用作為潤濕劑、分散劑、乳化劑或消泡劑。

**【0255】** 界面活性劑可以分類為非離子性、陰離子性或陽離子性。可用於本發明組成物的非離子界面活性劑包括但不限於：醇烷氧鹽，如基於天然及合成醇（其可為分支或線性）並從該醇類及環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物製備出的醇烷氧鹽；乙氧基胺、烷醇醯胺及乙氧基化烷醇醯胺；烷氧基化三酸甘油酯，如乙氧基化黃豆油、蓖麻油和油菜籽油；烷基酚烷氧鹽，如辛基酚乙氧化物（octylphenol ethoxylates）、壬基酚乙氧化物、二壬基酚乙氧化物及十二烷基苯酚乙氧化物（由苯酚及環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物所製備）；由環氧乙烷或環氧丙烷所製備的團聯聚合物以及其

中的終端嵌段由環氧丙烷所製備的反向團聯聚合物；乙氧基化脂肪酸；乙氧基化脂肪酯及油；乙氧基化甲酯；乙氧基化三苯乙烯苯酚（包括那些由環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物所製備者）；脂肪酸酯、甘油酯、羊毛脂為基礎的衍生物、聚乙氧基化酯，如聚乙氧基化山梨醇酐脂肪酸酯、聚乙氧基化山梨糖醇脂肪酸酯及聚乙氧基化甘油脂肪酸酯；其他山梨醇酐衍生物，如山梨醇酐酯；聚合界面活性劑，如無規共聚物、團聯共聚物、醇酸 PEG（聚乙二醇）樹脂、接枝或梳形聚合物及星形聚合物；聚乙二醇（PEGs）；聚乙二醇脂肪酸酯；聚矽氧為基礎的界面活性劑；以及糖衍生物，如蔗糖酯、烷基聚葡萄糖苷和烷基多醣。

**【0256】** 可用的陰離子界面活性劑包括但不限於：烷芳基磺酸及其鹽類；羧基化醇（carboxylated alcohol）或烷基酚乙氧化物（alkylphenol ethoxylates）；二苯磺酸鹽衍生物；木質素及木質素衍生物如木質磺酸鹽；順丁烯二酸或琥珀酸或彼等之酸酐；烯烴磺酸鹽；磷酸酯，如醇烷氧鹽的磷酸酯、烷基酚烷氧鹽的磷酸酯、及苯乙烯酚乙氧化物的磷酸酯；蛋白質為基礎的界面活性劑；肌胺酸衍生物；苯乙烯酚醚硫酸鹽；油和脂肪酸的硫酸鹽和磺酸鹽；乙氧基化烷基酚的硫酸鹽和磺酸鹽；醇類的硫酸鹽；乙氧基化醇類的硫酸鹽；胺和醯胺的磺酸鹽，如 *N,N*-烷牛磺酸鹽；苯、異丙苯、甲苯、二甲苯、十二苯和十三苯的磺酸鹽；縮合萘的磺酸鹽；萘及烷基萘的磺酸鹽；分餾石油的磺酸鹽；磺琥珀醯胺酸鹽（sulfosuccinamates）；及磺琥珀酸鹽（sulfosuccinates）及其衍生物，如二烷基磺琥珀酸鹽。

【0257】 可用的陽離子界面活性劑包括但不限於：醃胺及乙氧基化醃胺；胺，如 *N*-烷基丙二胺、三伸丙三胺及二伸丙四胺，以及乙氧基化胺、乙氧基化二胺和丙氧基化胺（由胺及環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物所製備）；胺鹽，如胺乙酸鹽及二胺鹽；四級銨鹽，如四級鹽、乙氧基化四級鹽及雙四級鹽；以及氧化胺，如烷二甲胺氧化物（alkyldimethylamine oxides）及雙-(2-羥乙基)-烷基胺氧化物（bis-(2-hydroxyethyl)-alkylamine oxides）。

【0258】 亦可用於本發明組成物者為非離子界面活性劑與陰離子界面活性劑的混合物，或是非離子界面活性劑與陽離子界面活性劑的混合物。非離子、陰離子及陽離子界面活性劑及其建議用法係揭示於各式公開參考文獻，包括 *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, annual American and International Editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co. ; Sisely and Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964 ; 以及 A. S. Davidson and B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh Edition, John Wiley and Sons, New York, 1987 。

【0259】 本發明的組成物也可包含配方輔助劑及添加劑，此為該領域中熟習技藝人士所習知的配方助劑（其中一些可被視為也提供固體稀釋劑、液體稀釋劑或界面活性劑的功能）。該配方輔助劑及添加劑可控制：pH（緩衝液）、加工過程中的發泡（消泡劑，例如聚有機矽氧烷）、活性成分的沈積（懸浮劑）、黏度（觸變增稠劑）、容器

內微生物生長（抗菌劑）、產品凍結（防凍劑）、顏色（染料/色素分散劑）、洗脫（成膜劑或黏著劑）、蒸發（蒸發阻滯劑）及其他配方特性。成膜劑包括例如聚乙酸乙烯、聚乙酸乙烯共聚物、聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯共聚物、聚乙烯醇、聚乙烯醇共聚物及蠟。配方輔助劑及添加劑之實例包括列示於以下文獻者：*McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*, annual International and North American editions published by McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.；以及 PCT 公開案第 WO 03/024222 號。

【0260】 式 1 化合物及任何其他的活性成分通常藉由將該活性成分溶解於一溶劑中，或藉由在液體或乾稀釋劑中將其磨碎，使之併入本發明的組成物中。溶液（包括可乳化濃縮物）可藉由簡單混合成分加以製備。若打算用作為可乳化濃縮物之液體組成物的溶劑與水不互溶，則通常會在用水稀釋時，加入乳化劑以乳化該含活性成分之溶劑。粒徑至高達 2,000  $\mu\text{m}$  的活性成分漿液可使用介質研磨機濕磨，以獲得平均直徑在 3  $\mu\text{m}$  以下的粒子。水性漿液可製成為成品懸浮濃縮物（請參見如 U.S. 3,060,084）或藉由噴霧乾燥進一步加工以形成水分散性粒劑。乾配方通常需要乾磨製程，其產生的平均粒子直徑在 2 到 10  $\mu\text{m}$  的範圍內。塵粉及粉劑可藉由摻合及通常加上研磨（如以錘磨或流體能量研磨機）製備。粒劑及丸劑可藉由將活性材料噴灑於預先形成之粒狀載體或藉由黏聚技術製備。見 Browning, “Agglomeration”, *Chemical Engineering*, December 4, 1967, pp 147–48, *Perry's Chemical Engineer's Handbook*, 4th Ed., McGraw-Hill,

New York, 1963, pages 8–57 及後文，以及 WO 91/13546。丸劑可如 U.S. 4,172,714 中所述者製備。水分散性與水溶性粒劑可如 U.S. 4,144,050、U.S. 3,920,442 與 DE 3,246,493 中所教示者製備。片劑可如 U.S. 5,180,587、U.S. 5,232,701 與 U.S. 5,208,030 所教示者製備。膜可如 GB 2,095,558 及 U.S. 3,299,566 中所教示者來製備。

【0261】 關於配方技術領域的進一步資訊，請參見 T. S. Woods, “The Formulator’s Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture” in *Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food–Environment Challenge*, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120–133。亦請參見 U.S. 3,235,361, Col. 6, line 16 through Col. 7, line 19 and Examples 10–41; U.S. 3,309,192, Col. 5, line 43 through Col. 7, line 62 and Examples 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138–140, 162–164, 166, 167 and 169–182 ; U.S. 2,891,855, Col. 3, line 66 through Col. 5, line 17 and Examples 1–4 ; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81–96 ; Hance et al., *Weed Control Handbook*, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989 ; 以及 *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000。

【0262】 在下面的實例中，所有的配方均以常規方式製備。化合物編號參照索引表 A 至 N 中之化合物。即使沒有進一步的闡述，相信

使用上述說明的熟習該項技術者仍能夠最大程度地利用本發明。因此，以下實例僅為說明之用，而絕非以任何方式限制本揭露。除非另有說明，百分比係按重量計。

### 實例 A

高強度濃縮物	
化合物 8	98.5%
二氧化矽氣凝膠	0.5%
合成非晶質細二氧化矽	1.0%

### 實例 B

可濕性粉劑	
化合物 14	65.0%
十二烷基酚聚乙二醇醚	2.0%
木質磺酸鈉	4.0%
矽鋁酸鈉	6.0%
蒙脫土（經煨燒）	23.0%

### 實例 C

粒劑	
化合物 16	10.0%
厄帖浦土粒劑（低揮發性物質，0.71/0.30 mm； U.S.S. No. 25-50 篩）	90.0%

### 實例 D

擠出丸劑	
化合物 19	25.0%
無水硫酸鈉	10.0%
粗木質磺酸鈣	5.0%
烷基萘磺酸鈉	1.0%
鈣/鎂膨土	59.0%

### 實例 E

可乳化濃縮物	
化合物 41	10.0%

聚氧乙烯山梨糖醇己油酸(polyoxyethylene sorbitol hexoleate)	20.0%
C6-C10 脂肪酸甲酯	70.0%

## 實例 F

## 微乳液

化合物 42	5.0%
聚乙烯吡咯啉酮-乙酸乙烯酯共聚物	30.0%
烷基聚葡萄糖苷 (alkylpolyglycoside)	30.0%
甘油單油酸酯 (glyceryl monooleate)	15.0%
水	20.0%

## 實例 G

## 種子處理劑

化合物 51	20.00%
聚乙烯吡咯啉酮-乙酸乙烯酯共聚物	5.00%
褐煤酸蠟	5.00%
木質磺酸鈣	1.00%
聚氧乙烯/聚氧丙烯團聯共聚物	1.00%
硬脂醇 (POE 20)	2.00%
聚有機矽烷	0.20%
著色劑紅色染料	0.05%
水	65.75%

## 實例 H

## 肥料棒

化合物 54	2.5%
吡咯啉酮-苯乙烯共聚物	4.8%
三苯乙烯基苯基 16-乙氧化物(tristyrylphenyl 16-ethoxylate)	2.3%
滑石	0.8%
玉米澱粉	5.0%
緩釋肥料	36.0%
高嶺土	38.0%
水	10.6%



## 實例 I

懸浮濃縮物	
化合物 55	35%
丁基聚氧乙烯/聚丙烯團聯共聚物	4.0%
硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
苯乙烯丙烯酸聚合物	1.0%
三仙膠	0.1%
丙二醇	5.0%
以聚矽氧為基礎的消泡劑	0.1%
1,2-苯并異噻唑啉-3-酮 (1,2-benzisothiazolin-3-one)	0.1%
水	53.7%

## 實例 J

水乳液	
化合物 76	10.0%
丁基聚氧乙烯/聚丙烯團聯共聚物	4.0%
硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
苯乙烯丙烯酸聚合物	1.0%
三仙膠	0.1%
丙二醇	5.0%
以聚矽氧為基礎的消泡劑	0.1%
1,2-苯并異噻唑啉-3-酮 (1,2-benzisothiazolin-3-one)	0.1%
以芳香族石油為基礎之碳氫化合物	20.0
水	58.7%

## 實例 K

油分散液	
化合物 19	25%
聚氧乙烯山梨糖醇六油酸酯	15%
有機修飾的膨土黏土(bentonite clay)	2.5%
脂肪酸甲酯(fatty acid methyl ester)	57.5%

## 實例 L

濃懸乳液	
化合物 42	10.0%
益達胺	5.0%
丁基聚氧乙烯/聚丙烯團聯共聚物	4.0%
硬脂酸/聚乙二醇共聚物	1.0%
苯乙烯丙烯酸聚合物	1.0%

三仙膠	0.1%
丙二醇	5.0%
以聚矽氧為基礎的消泡劑	0.1%
1,2-苯并異噻唑啉-3-酮 (1,2-benzisothiazolin-3-one)	0.1%
以芳香族石油為基礎之碳氫化合物	20.0%
水	53.7%

**【0263】** 本發明之化合物對許多的無脊椎動物害蟲具有活性。這些害蟲包含棲息於不同環境之無脊椎動物，如植物葉子、根、土壤、採收的農作物或其他食物、建築結構或動物皮膚。這些害蟲包含例如以葉子（包括葉片、莖、花及果實）、種子、木材、紡織纖維或動物血液或組織為食的無脊椎動物，因此造成如生長或儲存農藝作物、森林、溫室作物、觀賞性植物、苗圃作物、儲存食物或纖維產品、房子或其他結構或其內容物之損傷或破壞，或者對動物健康或公共衛生有害。熟悉該項技術之人士將明瞭不是所有化合物對全部害蟲的所有生長階段皆有相同效果。

**【0264】** 這些化合物與組成物因此可用於農藝上保護田間作物，使其免受植食性無脊椎動物害蟲侵害，也可在非農藝上保護其他園藝作物與植物，使其免受植食性無脊椎動物害蟲侵害。此效用包括保護包含基因材料的作物與其他植物（即農藝的與非農藝的），該基因材料係藉由基因遺傳工程（即基因轉殖）導入或藉由基因突變改良以提供有利的特性。該等性狀之實例包括除草劑耐受性、對食植物害蟲的抵抗力（例如，昆蟲、蟎、蚜蟲、蜘蛛、線蟲、蝸牛、植物病原性真菌、細菌及病毒）、改善植物生長、增加對有害生長條件之耐受性（如高或低溫、低或高土壤濕度、及高鹽分）、增加開花與結果、提

高收成量、更快成熟、提高收成產品之品質及/或營養價值或改善收成產品之儲存或處理性質。基因轉殖植物可經改良以表現多種性狀。含有基因工程或突變形成所提供之性狀的植物例子包括表現出殺蟲性蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)毒素之玉米、棉花、大豆與馬鈴薯變種，諸如 YIELD GARD<sup>®</sup>、KNOCKOUT<sup>®</sup>、STARLINK<sup>®</sup>、BOLLGARD<sup>®</sup>、NuCOTN<sup>®</sup>及 NEWLEAF<sup>®</sup>、INVICTA RR2 PROTM，以及耐除草劑之玉米、棉花、大豆與油菜籽變種，諸如 ROUNDUP READY<sup>®</sup>、LIBERTY LINK<sup>®</sup>、IMI<sup>®</sup>、STS<sup>®</sup>及 CLEARFIELD<sup>®</sup>，以及表現出 *N*-乙醯基轉換酶(GAT)以對於草甘膦除草劑提供抗性之作物，或者含有 HRA 基因（對抑制乙醯乳酸合成酶(ALS)之除草劑提供抗性）之作物。本化合物與組成物可能與經由遺傳工程導入或基因突變改良方式獲得之性狀產生協同交互作用，因此增加該等性狀之表現型表現或有效性，或者增加本化合物與組成物防治無脊椎動物害蟲之效果。尤其，本發明化合物與組成物可能與對無脊椎動物害蟲具有毒性的表現型表現之蛋白質或其他天然產物協同交互作用，以提供大於相加效果的害蟲防治。

【0265】 本發明之組成物亦可選擇地包含植物養分，例如，肥料組成物，其包含至少一種選自氮、磷、鉀、硫、鈣、鎂、鐵、銅、硼、錳、鋅及鉬之植物養分。值得注意的是組成物包含至少一種肥料組成物，該肥料組成物包含至少一種選自氮、磷、鉀、硫、鈣及鎂之植物養分。進一步包含至少一種植物養分之本發明之組成物可為液體或固體形式。值得注意的是固體配方為粒劑、小棒狀劑(small sticks)

或片劑之形式。包含肥料組成物之固體配方可經由將本發明之化合物或組成物與肥料組成物連同配方成分一起混合，接著以如粒化或擠壓之方法製備該配方而製備。或者固體配方可藉由將本發明化合物或組成物在揮發溶劑中之溶液或懸浮液噴灑至先前製備好之肥料組成物上，並接著將溶劑揮發而製備，該肥料組成物為尺寸穩定的混合物之形式，例如：粒劑、小棒狀劑（small sticks）或片劑。

**【0266】** 非農藝用途係指在除作物植物領域外之領域的無脊椎動物害蟲防治。本發明之化合物及組成物之非農藝用途包括在儲存之穀物、豆類及其他糧食中及在諸如衣服及地毯之織物中的無脊椎動物害蟲防治。本發明之化合物及組成物之非農藝用途亦包括在觀賞植物、森林、庭院、道路及鐵路用地旁及在諸如草地、高爾夫球場及牧場之草皮上的無脊椎動物害蟲防治。本發明之化合物及組成物之非農藝用途亦包括在可由人類及/或伴侶動物、農場動物、牧場動物、動物園動物或其他動物居住之房屋及其他建築物中的無脊椎動物害蟲防治。本發明之化合物及組成物之非農藝用途亦包括防治可破壞木材或建築物中使用之其他結構材料的害蟲，諸如白蟻。

**【0267】** 本發明之化合物及組成物之非農藝用途亦包括藉由防治寄生性或傳播感染性疾病之無脊椎動物害蟲來保護人類與動物之健康。動物寄生蟲之防治包括防治寄生在宿主動物身體表面（例如，肩膀、腋窩、腹部、大腿內側部分）之外寄生蟲，及寄生在宿主動物身體內部（例如，胃、腸、肺、靜脈、皮膚下、淋巴組織）之內寄生蟲。外寄生性或疾病傳播害蟲包括（例如）恙蟎、蜱、虱、蚊子、蒼

蠅、蟎及跳蚤。內寄生蟲包括心絲蟲、鉤蟲及蠕蟲。本發明之化合物及組成物適於系統性及/或非系統性防治寄生蟲於動物之侵染或感染。本發明之化合物及組成物尤其適於對抗外寄生蟲或疾病傳播害蟲。本發明之化合物及組成物適於用來對抗侵擾農業工作動物的寄生蟲，例如牛、綿羊、山羊、馬、豬、驢、駱駝、水牛、兔、母雞、火雞、鴨、鵝及蜜蜂；寵物動物及家畜，例如狗、貓、寵物鳥及觀賞魚；以及所謂的實驗動物，例如倉鼠、天竺鼠、大鼠及小鼠。透過打擊這些寄生蟲，死亡率及產能縮減（就肉、乳、羊毛、皮、蛋、蜂蜜等而言）會有所降低，所以施用包含本發明化合物之組成物會讓動物養殖更加經濟簡單。

**【0268】** 農藝或非農藝無脊椎動物害蟲的例子包括鱗翅目的卵、幼蟲與成蟲，諸如夜蛾科家族中的行軍蟲、夜盜蟲、尺蠖與實夜蛾 (*heliothine*)（例如，粉紅螟（大螟(*Sesamia inferens* Walker)）、玉米螟（玉米蛀莖夜蛾(*Sesamia nonagrioides* Lefebvre)）、南方行軍蟲（南方灰翅夜蛾(*Spodoptera eridania* Cramer)）、秋行軍蟲（草地貪夜蛾(*Spodoptera frugiperda* J. E. Smith)）、甜菜行軍蟲（甜菜夜蛾(*Spodoptera exigua* Hübner)）、棉樹葉蟲（海灰薄翅夜蛾(*Spodoptera littoralis* Boisduval)）、黃條行軍蟲（黃條粘蟲(*Spodoptera ornithogalli* Guenée)）、黑夜盜蟲（球菜夜蛾(*Agrotis ipsilon* Hufnagel)）、黎豆毛蟲（黎豆夜蛾(*Anticarsia gemmatalis* Hübner)）、青蟲（綠果夜蛾(*Lithophane antennata* Walker)）、甘藍菜行軍蟲（甘藍夜蛾(*Barathra brassicae* Linnaeus)）、大豆尺蠖（大

豆夜蛾(*Pseudoplusia includens* Walker) )、甘藍菜尺蠖(粉斑夜蛾(*Trichoplusia ni* Hübner))、菸草芽蟲(菸芽夜蛾(*Heliothis virescens* Fabricius))；螟蛾科(Pyralidae)之蛀蟲、鞘蛾幼蟲(casebearers)、結網蟲(webworms)、錐蟲(coneworms)、甘藍毛蟲(cabbageworms)及雕葉蟲(skeletonizers)(如：歐洲玉米蛀蟲(*Ostrinia nubilalis* Hübner)、臍橙蟲(*Amyelois transitella* Walker)、玉米根結網蟲(玉米根草螟 *Crambus caliginosellus* Clemens)、草地結網蟲(螟蛾科 Pyralidae: *Crambinae*)如蒼螟(稻切葉野螟蛾(*Herpetogramma licarsisalis* Walker))、甘蔗螟(甘蔗二點螟(*Chilo infuscatellus* Snellen))、番茄小螟(茄黃斑螟(*Neoleucinodes elegantalis* Guenée))、綠捲葉蟲(稻縱捲葉野螟(*Cnaphalocrocis medinalis*))、葡萄捲葉蟲(葡萄野螟(*Desmia funeralis* Hübner))、甜瓜蟲(甜瓜野螟(*Diaphania nitidalis* Stoll))、甘藍菜心鱗翅(*Helluala hydralis* Guenée)、黃螟(三化螟(*Scirpophaga incertulas* Walker))、早發蛀心蟲(early shoot borer)(粟灰螟(*Scirpophaga infuscatellus* Snellen))、白螟(white stem borer)(稻白螟(*Scirpophaga innotata* Walker))、頂發蛀心蟲(top shoot borer)(甘蔗白禾螟蛾(*Scirpophaga nivella* Fabricius))、黑頭稻螟(黑頭條螟(*Chilo polychrysus* Meyrick))、稻條螟(水稻二化螟(*Chilo suppressalis* Walker))、甘藍菜蠶(甘藍大菜螟(*Crociodolomia binotalis* English))；卷蛾科(Tortricidae)之小卷葉蛾、蚜蟲、種子蟲及果實蟲(例如：蘋果卷葉蛾(蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*

Linnaeus) )、葡萄漿果小卷蛾 (葡萄螟蛾 (*Endopiza viteana* Clemens) )、東方果蠹蛾 (梨小食心蟲 (*Grapholita molesta* Busck) )、柑橘偽蘋果蠹蛾 (蘋果異形小卷蛾 (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick) )、柑橘蛀蟲 (柑橘螟蟲 (*Ecdytolopha aurantiana* Lima) )、紅帶小卷葉蛾 (紅帶卷蛾 (*Argyrotaenia velutinana* Walker) )、斜帶小卷葉蛾 (斜紋卷葉蛾 (*Choristoneura rosaceana* Harris) )、蘋果淺褐卷葉蛾 (淺棕蘋果蛾 (*Epiphyas postvittana* Walker) )、歐洲葡萄漿果蛾 (葡萄螟蛾 (*Eupoecilia ambiguella* Hübner) )、蘋果頂芽卷葉蛾 (褐卷蛾 (*Pandemis pyrusana* Kearfott) )、雜食性小卷葉蛾 (荷蘭石竹小卷蛾 (*Platynota stultana* Walsingham) )、棒狀果樹卷葉蛾 (疆褐卷蛾 (*Pandemis cerasana* Hübner) )、蘋果褐卷葉蛾 (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller) )；及許多其他具經濟重要性的鱗翅目 (例如：菱紋背蛾 (diamondback moth) (小菜蛾 (*Plutella xylostella* Linnaeus) )、紅鈴蟲 (棉紅鈴蟲 (*Pectinophora gossypiella* Saunders) )、秋千毛蟲 (舞毒蛾 (*Lymantria dispar* Linnaeus) )、桃小食心蟲 (桃小食蛾 (*Carposina niponensis* Walsingham) )、桃枝蛀蟲 (桃枝麥蛾 (*Anarsia lineatella* Zeller) )、馬鈴薯塊莖蟲 (馬鈴薯塊莖蛾 (*Phthorimaea operculella* Zeller) )、點帶狀潛葉蛾 (斑點潛葉蛾 (*Lithocolletis blancardella* Fabricius) )、亞洲蘋果潛葉蛾 (金紋細蛾 (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura) )、稻縱卷葉螟 (美洲稻弄蝶 (*Lerodea eufala* Edwards) )、蘋果潛葉蛾 (旋紋潛葉蛾 (*Leucoptera scitella*

Zeller) ) ; 蜚蠊目 (Blattodea) 之卵、幼蟲及成蟲，包括姬蜚蠊科 (Blattellidae) 及蜚蠊科 (Blattidae) 之蟑螂 (例如：東方蟑螂 (東方蜚蠊(*Blatta orientalis* Linnaeus))、亞洲蟑螂 (亞洲蜚蠊(*Blattella asahinai* Mizukubo))、德國蟑螂 (德國小蠊(*Blattella germanica* Linnaeus))、褐帶蟑螂 (褐帶蜚蠊(*Supella longipalpa* Fabricius))、美洲蟑螂 (美洲大蠊(*Periplaneta americana* Linnaeus))、褐色蟑螂 (褐色蜚蠊(*Periplaneta brunnea* Burmeister))、馬德拉蟑螂 (馬德拉蜚蠊(*Leucophaea maderae* Fabricius))、煙棕蟑螂 (煙棕蜚蠊(*Periplaneta fuliginosa* Service))、澳洲蟑螂 (澳洲蜚蠊(*Periplaneta australasiae* Fabr.))、灰色蟑螂 (灰色蜚蠊(*Nauphoeta cinerea* Olivier))及光滑蟑螂 (光滑蜚蠊(*Symploce pallens* Stephens)) ; 鞘翅目 (Coleoptera) 之卵、食葉、食果實、食根、食種子及食泡沫組織之幼蟲及成蟲，包括長角象甲科 (Anthribidae)、豆象科 (Bruchidae) 與象蟲科 (Curculionidae) 之象鼻蟲 (例如：棉籽象鼻蟲 (棉鈴象甲(*Anthonomus grandis* Boheman))、稻水象鼻蟲 (稻象甲(*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel))、穀倉象鼻蟲 (穀象(*Sitophilus granarius* Linnaeus))、米象 (米象鼻蟲(*Sitophilus oryzae* Linnaeus))、一年生藍草象鼻蟲 (早熟禾象鼻蟲(*Listronotus maculicollis* Dietz))、藍草喙甲 (小型穀喙甲(*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal))、狩獵型喙甲 (草皮步行象鼻蟲(*Sphenophorus venatus vestitus*))、丹佛喙甲 (丹佛穀喙甲(*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)) ; 葉甲科 (Chrysomelidae) 之跳甲、黃瓜



葉甲、根蟲、葉甲、馬鈴薯甲蟲及潛葉蛾（如：科羅拉多馬鈴薯甲蟲 (Colorado potato beetle) (馬鈴薯甲蟲 (*Leptinotarsa decemlineata* Say))、西方玉米根蟲 (玉米根螢葉甲(*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte))；金龜子及其他金龜子科 (family Scarabaeidae) 的甲蟲 (例如日本麗金龜(*Popillia japonica* Newman)、東方麗金龜(*Anomala orientalis* Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud)、圓頭犀金龜 (*Cyclocephala borealis* Arrow)、圓頭無斑犀金龜 (*Cyclocephala immaculata* Olivier 或 *C. lurida* Bland)、蜉金龜及白蟻螯 (*Aphodius* spp.)、黑金龜(*Ataenius spretulus* Haldeman)、青銅金龜 (*Cotinis nitida* Linnaeus)、紫絨鰓角金龜 (*Maladera castanea* Arrow)、臺灣青銅金龜(*Phyllophaga* spp.)及歐洲金龜(*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky))；鯉節蟲科 (Dermestidae) 之地毯甲蟲；叩甲科 (Elateridae) 之線蟲；小蠹科 (Scolytidae) 之小蠹蟲 (bark beetles) 及擬步甲科 (Tenebrionidae) 之粉甲蟲 (bark beetles)。

【0269】 此外，農藝及非農藝害蟲包括：革翅目 (Dermaptera) 之卵、成蟲及幼蟲，包括：蠹蝨科 (Forficulidae) 之地蜈蚣 (例如：歐洲地蜈蚣 (歐洲蠹蝨(*Forficula auricularia* Linnaeus)、黑地蜈蚣 (黑蠹蝨(*Chelisoche morio* Fabricius))；半翅目 (Hemiptera) 及同翅目 (Homoptera) 之卵、未成熟蟲、成蟲及若蟲，像是盲椿科 (Miridae) 之盲椿、蟬科 (Cicadidae) 之蟬、葉蟬科 (Cicadellidae) 之葉蟬 (例如，微葉蟬屬(*Empoasca* spp.)、臭蟲科 (Cimicidae) 之床蟲 (例如：溫帶臭蟲 (*Cimex lectularius*

Linnaeus))、蠟蟬科 (Fulgoroidea) 及飛虱科 (Delphacidae) 之蠟蟬、角蟬科 (Membracidae) 之角蟬 (treehoppers)、木虱科 (Psyllidae) 之木虱 (psyllids)、粉虱科 (Aleyrodidae) 之白粉虱 (whiteflies)、蚜科 (Aphididae) 之蚜蟲、根瘤蚜科 (Phylloxera) 之根瘤蚜蟲、粉蚧科 (Pseudococcidae) 之粉蚧 (mealybugs)、蚧科 (Coccidae)、盾蚧科 (Diaspididae) 及珠蚧科 (Margarodidae) 之介殼蟲、網蝽科 (Tingidae) 之網蝽、蝽科 (Pentatomidae) 之蝽、長蝽科 (Lygaeidae) 之長蝽 (例如：多毛蝽 (多毛長蝽 (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon)) 及南方蝽 (南方長蝽 (*Blissus insularis* Barber))) 及其他種子蝽、沫蟬科 (Cercopidae) 之沫蟬、緣蝽科 (Coreidae) 之緣蝽及紅蝽科 (Pyrrhocoridae) 之紅蝽及汗棉蟲。

【0270】 農藝與非農藝害蟲亦包括：蜱蟎目 (Acari) (蟎) 之卵、幼蟲、若蟲及成蟲，像是葉蟎科 (Tetranychidae) 之蛛蟎及紅蟎 (例如：歐洲紅蟎 (歐洲葉蟎 (*Panonychus ulmi* Koch))、二點葉蟎 (棉葉蟎 (*Tetranychus urticae* Koch))、邁氏葉蟎 (*Tetranychus mcdanieli* McGregor))；細鬚蟎科 (Tenuipalpidae) 之短鬚蟎 (例如：桔短鬚蟎 (citrus flat mite) (劉氏短鬚蟎 (*Brevipalpus lewisi* McGregor)))；瘿蟎科 (Eriophyidae) 之鏽蟎及芽蟎及其他食葉蟎及對於人類及動物健康重要之蟎，亦即表皮蟎科 (Epidermoptidae) 之塵蟎、蠕形蟎科 (Demodicidae) 之蠕形蟎、食甜蟎科 (Glycyphagidae) 之穀蟎；硬蜱科 (Ixodidae) 之蜱，通常稱為硬蜱

(例如：鹿蜱(黑腳硬蜱(*Ixodes scapularis* Say))、澳大利亞致癱瘓蜱(全環硬蜱(*Ixodes holocyclus* Neumann))、美洲狗蜱(變異草蜱(*Dermacentor variabilis* Say))、孤星壁虱(美洲花蜱(*Amblyomma americanum* Linnaeus))及軟蜱科(Argasidae)之蜱，通常稱為軟蜱(例如：回歸熱蜱(relapsing fever tick)(特氏鈍緣蜱(*Ornithodoros turicata*))、常見雞蜱(放射狀銳緣蜱(*Argas radiatus*))；怪蟎科(Psoroptidae)、蒲蟎科(Pyemotidae)及疥蟎科(Sarcoptidae)之疥蟎；直翅目(Orthoptera)的卵、成蟲與未成熟蟲(immature)，包括蝗蟲、蚱蜢與蟋蟀(例如遷移型蝗蟲(例如血黑蝗(*Melanoplus sanguinipes* Fabricius)、異黑蝗(*M. differentialis* Thomas))、美洲蝗蟲(例如美國蚱(*Schistocerca americana* Drury))、沙漠蚱蜢(*Schistocerca gregaria* Forskal)、遷移型蚱蜢(*Locusta migratoria* Linnaeus)、灌木蚱蜢(*Zonocerus* spp.)、家蟋蟀(*Acheta domesticus* Linnaeus)、螻蛄(例如褐螻蛄(*Scapteriscus vicinus* Scudder)與南方螻蛄(*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos))；雙翅目(Diptera)的卵、成蟲與未成熟蟲，包括斑潛蠅(例如斑潛蠅屬(*Liriomyza* spp.)，如蛇根鹼植物斑潛蠅(*Liriomyza sativae* Blanchard))、糠蚊、果蠅(Tephritidae)、瑞典小蠅(例如 *Oscinella frit* Linnaeus)、土蛆、家蠅(例如 *Musca domestica* Linnaeus)、小型家蠅(例如夏廁蠅(*Fannia canicularis* Linnaeus)、異穀種蠅(*F. femoralis* Stein)、廢螯蠅(例如螯蠅(*Stomoxys calcitrans* Linnaeus))、秋家蠅、角蠅、麗蠅(例如金蠅屬(*Chrysomya* spp.)、

彩虹蠅屬(*Phormia* spp.)、與其他小實蠅害蟲、馬蠅(例如牛虻屬(*Tabanus* spp.))、膚蠅(例如馬胃蠅(*Gastrophilus* spp.))、狂蠅(*Oestrus* spp.)、牛蠅(例如 *Hypoderma* spp.)、鹿蠅(例如 *Chrysops* spp.)、蜉蠅(例如羊蝨蠅(*Melophagus ovinus* Linnaeus))與其他短角亞目(Brachycera)、蚊(例如伊蚊屬(*Aedes* spp.)、按蚊屬(*Anopheles* spp.)、家蚊屬(*Culex* spp.))、黑蠅(例如原蚋屬(*Prosimulium* spp.)、蚋屬(*Simulium* spp.))、小黑蚊、沙蠅、尖眼蕈蚊及其他長角亞目(Nematocera)；纓翅目(Thysanoptera)之卵、成蟲及未成熟蟲，包括洋蔥薊馬(煙薊馬(*Thrips tabaci* Lindeman))、花薊馬(花薊馬屬(*Frankliniella* spp.))及其他食葉薊馬；膜翅目(Hymenoptera)之昆蟲害蟲，包括蟻科(Formicidae)之螞蟻，包括佛羅里達木蟻(Florida carpenter ant)(*Camponotus floridanus* Buckley)、紅色木蟻(紅弓背蟻(*Camponotus ferrugineus* Fabricius))、黑色木蟻(賓州黑木工蟻(*Camponotus pennsylvanicus* De Geer))、白足蟻(白足狡臭蟻(*Technomyrmex albipes* fr. Smith))、大頭蟻(大頭蟻屬(*Pheidole* sp.))、蜜蟻(黑頭慌蟻(*Tapinoma melanocephalum* Fabricius))；法老蟻(Pharaoh ant)(廚蟻(*Monomorium pharaonis* Linnaeus))、小火蟻(小火紅蟻(*Wasmannia auropunctata* Roger))、火蟻(熱帶火蟻(*Solenopsis geminata* Fabricius))、入侵紅火蟻(*Solenopsis invicta* Buren)、阿根廷蟻(*Iridomyrmex humilis* Mayr)、狂蟻(長角黃山蟻(*Paratrechina longicornis* Latreille))、鋪道蟻(路舍蟻(*Tetramorium caespitum*

Linnaeus) )、玉米田蟻 (異色草蟻(*Lasius alienus* Förster)) 及臭家蟻 (酸臭蟻(*Tapinoma sessile* Say))。其他膜翅目 (Hymenoptera) 包括蜜蜂 (包括木蜂)、大黃蜂、小黃蜂、胡蜂與鋸蜂 (葉蜂屬 (*Neodiprion* spp.)) ; 麥莖蜂屬 (*Cephus* spp.)) ; 等翅目 (Isoptera) 的昆蟲害蟲包括白蟻科 (Termitidae) 中的白蟻 (例如大白蟻屬 (*Macrotermes* sp.)、土白蟻屬 (*Odontotermes obesus* Rambur)、木白蟻科 (*Kalotermitidae*) (例如堆沙白蟻屬 (*Cryptotermes* sp.)) 與犀白蟻科 (*Rhinotermitidae*) (例如散白蟻屬 (*Reticulitermes* sp.)、家白蟻屬 (*Coptotermes* sp.)、南美黑白蚊 (*Heterotermes tenuis* Hagen))、東部地下白蟻 (*Reticulitermes flavipes* Kollar)、西部地下白蟻 (*Reticulitermes hesperus* Banks)、台灣地下白蟻 (*Coptotermes formosanus* Shiraki)、西印度乾木白蟻 (*Incisitermes immigrans* Snyder)、蛀木白蟻 (*Cryptotermes brevis* Walker)、乾木白蟻 (*Incisitermes snyderi* Light)、東南部地下白蟻 (*Reticulitermes virginicus* Banks)、西部乾木白蟻 (*Incisitermes minor* Hagen)、樹棲白蟻如象白蟻屬 (*Nasutitermes* sp.) 及其他具有經濟重要性的白蟻 ; 纓尾目 (Thysanura) 之昆蟲害蟲, 例如 : 蠹蟲 (衣魚 (*Lepisma saccharina* Linnaeus)) 及小灶衣魚 (家衣魚 (*Thermobia domestica* Packard)) ; 食毛目 (Mallophaga) 之昆蟲害蟲, 且包括頭蝨 (人頭蝨 (*Pediculus humanus capitis* De Geer))、體虱 (人體虱 (*Pediculus humanus* Linnaeus))、雞體虱 (大雞虱 (*Menacanthus stramineus* Nitsch))、狗鬣毛虱 (犬鬣毛虱 (*Trichodectes canis* De Geer))、雞姬蝨 (雞圓羽

虱(*Goniocotes gallinae* De Geer))、綿羊體虱(綿羊虱(*Bovicola ovis* Schrank))、短鼻牛虱(牛血虱(*Haematopinus eurysternus* Nitzsch))、長鼻牛虱(牛顎虱(*Linognathus vituli* Linnaeus))及其他侵襲人類及動物之吸吮性及咀嚼性寄生虱；蚤目(Siphonoptera)之昆蟲害蟲，包括東方鼠蚤(印度鼠蚤(*Xenopsylla cheopis* Rothschild))、貓蚤(貓櫛頭蚤(*Ctenocephalides felis* Bouche))、狗蚤(狗櫛頭蚤(*Ctenocephalides canis* Curtis))、雞蚤(離角葉蚤(*Ceratophyllus gallinae* Schrank))、黏貼蚤(吸著蚤(*Echidnophaga gallinacea* Westwood))、人蚤(致癢蚤(*Pulex irritans* Linnaeus))及侵襲哺乳動物及鳥類之其他跳蚤。涵蓋之其他節肢動物害蟲包括：蜘蛛目(Araneae)之蜘蛛，例如：褐絲蛛(褐皮花蛛(*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik))及黑寡婦蜘蛛(黑寡婦球腹蛛(*Latrodectus mactans* Fabricius))及蠍目(Scutigeroidea)之蜈蚣，如：家蜈蚣(蠍(*Scutigera coleoptrata* Linnaeus))。

【0271】 儲存穀物之無脊椎動物害蟲的實例包括大穀蠹(*Prostephanus truncatus*)、小穀長蠹蟲(穀蠹(*Rhyzopertha dominica*))、米象(米象鼻蟲(*Stiophilus oryzae*))、玉米象(*Stiophilus zeamais*)、豇豆象(四紋豆象(*Callosobruchus maculatus*))、赤擬穀盜(擬穀盜(*Tribolium castaneum*))、穀倉象鼻蟲(穀象(*Stiophilus granarius*))、印度穀蛾(*Plodia interpunctella*)、地中海粉螟(粉斑螟(*Ephesia kühniella*))及銹赤扁穀盜(角胸粉扁蟲(*Cryptolestis ferrugineus*))。

【0272】 本發明化合物可能對於線蟲綱、條蟲綱、吸蟲綱與鉤頭動物門的成員具有活性，包括圓蟲目(Strongylida)、蛔蟲目(Ascaridida)、尖尾目(Oxyurida)、桿形目(Rhabditida)、旋尾目(Spirurida)與刺嘴目(Enoplida)中具有經濟重要性的成員，諸如但不限於具有經濟重要性的農業害蟲（即 *Meloidogyne* 屬中的根瘤線蟲、*Pratylenchus* 屬中的腐線蟲、*Trichodorus* 屬中的殘根線蟲等）以及動物與人類健康害蟲（即所有具有經濟重要性的吸蟲、條蟲與蛔蟲，諸如馬圓線蟲(*Strongylus vulgaris*)、犬蛔蟲(*Toxocara canis*)、羊胃勾蟲(*Haemonchus contortus*)、犬心絲蟲(*Dirofilaria immitis* Leidy)、馬葉狀條蟲(*Anoplocephala perfoliata*)、牛羊肝吸蟲(*Fasciola hepatica* Linnaeus)等)。

【0273】 本發明化合物可對於鱗翅目中的害蟲具有抗性（例如，棉葉蟲(*Alabama argillacea* Hübner)、果樹捲葉蟲(*Archips argyrospila* Walker)、歐洲捲葉蟲(*A. rosana* Linnaeus)與其他 *Archips* 物種、稻螟(*Chilo suppressalis* Walker)、稻捲葉螟(*Cnaphalocrosis medinalis* Guenée)、玉米根草螟(*Crambus caliginosellus* Clemens)、藍草草螟(*Crambus teterrellus* Zincken)、蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella* Linnaeus)、鼎點金剛鑽(*Earias insulana* Boisduval)、綠帶金剛鑽(*Earias vittella* Fabricius)、美洲金鋼鑽(*Helicoverpa armigera* Hübner)、玉米穗蟲(*Helicoverpa zea* Boddie)、菸草芽蟲(*Heliothis virescens* Fabricius)、草地螟(*Herpetogramma licarsisalis* Walker)、葡萄螟蛾(*Lobesia botrana* Denis & Schiffermüller)、棉紅鈴蟲

(*Pectinophora gossypiella* Saunders)、柑橘斑潛蠅(*Phyllocnistis citrella* Stainton)、大白蝶(*Pieris brassicae* Linnaeus)、小白蝶(*Pieris rapae* Linnaeus)、菱紋背蛾(*Plutella xylostella* Linnaeus)、甜菜行軍蟲(*Spodoptera exigua* Hübner)、菸草夜盜蟲(斜紋夜盜蟲(*Spodoptera litura* Fabricius))、秋行軍蟲(*Spodoptera frugiperda* J. E. Smith)、甘藍菜尺蠖(*Trichoplusia ni* Hübner)與番茄斑潛蠅(*Tuta absoluta* Meyrick)。

【0274】 本發明化合物對於來自同翅目的下列成員具有明顯活性：豌豆蚜(*Acyrtosiphon pisum* Harris)、黑豆蚜(*Aphis craccivora* Koch)、黑豆蚜(*Aphis fabae* Scopoli)、棉蚜(*Aphis gossypii* Glover) (棉花蚜、甜瓜蚜)、蘋果蚜(*Aphis pomi* De Geer)、芹菜蚜(*Aphis spiraecola* Patch) (繡線菊蚜)、馬鈴薯蚜(*Aulacorthum solani* Kaltentbach) (毛地黃蚜)、草莓毛管蚜(*Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell) (草莓蚜)、麥雙尾蚜(*Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko) (俄羅斯小麥蚜)、蘋粉紅劣蚜(*Dysaphis plantaginea* Paaserini) (玫瑰蘋果蚜)、蘋果綿蚜(*Eriosoma lanigerum* Hausmann) (蘋綿蚜)、桃粉蚜(*Hyalopterus pruni* Geoffroy) (桃大尾蚜)、偽菜蚜(*Lipaphis erysimi* Kaltentbach) (蕪菁蚜)、薔薇麥蚜(*Metopolophium dirrhodum* Walker) (麥蚜)、馬鈴薯網管蚜(*Macrosiphum euphorbiae* Thomas) (馬鈴薯蚜)、桃蚜(*Myzus persicae* Sulzer) (桃-馬鈴薯蚜、綠桃蚜)、萵苣蚜(*Nasonovia ribisnigri* Mosley) (萵苣蚜)、根蚜與蟲癭蚜(*Pemphigus* spp.)、玉米



葉蚜(*Rhopalosiphum maidis* Fitch)、烏櫻桃-燕麥蚜(*Rhopalosiphum padi* Linnaeus)、綠蚜蟲(*Schizaphis graminum* Rondani)、英國麥蚜(*Sitobion avenae* Fabricius)、斑點苜蓿蚜(*Therioaphis maculata* Buckton)、黑柑橘蚜(*Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe)與褐柑橘蚜(*Toxoptera citricida* Kirkaldy)；球蚜(*Adelges* spp.)；長山核桃根瘤蚜(*Phylloxera devastatrix* Pergande (美洲山核桃根瘤蚜))；菸草粉虱、甘薯粉虱(*Bemisia tabaci* Gennadius)、銀葉粉虱(*Bemisia argentifolii* Bellows & Perring)、柑橘粉虱(桔粉虱(*Dialeurodes citri* Ashmead))及溫室粉虱(溫室粉虱(*Trialeurodes vaporariorum* Westwood))；馬鈴薯葉蟬(*Empoasca fabae* Harris)、小褐飛蝨(*Laodelphax striatellus* Fallen)、翠菊葉蟬(*Macrolestes quadrilineatus* Forbes)、綠葉蟬(*Nephotettix cincticeps* Uhler)、米葉蟬(*Nephotettix nigropictus* Stål)、褐飛蝨(*Nilaparvata lugens* Stål)、玉米飛蝨(*Peregrinus maidis* Ashmead)、白背飛蝨(*Sogatella furcifera* Horvath)、稻飛蝨(*Sogatodes orizicola* Muir)、白蘋果葉蟬(*Typhlocyba pomaria* McAtee)、葡萄葉蟬(*Erythroneoura* spp.) (葡萄葉蟬)；十七年蟬(*Magicidada septendecim* Linnaeus) (週期蟬)；吹綿蚧殼蟲(綿團蚧殼蟲(*Icerya purchasi* Maskell))、梨圓盾蚧(聖約瑟蟲(*Quadraspidiotus perniciosus* Comstock))；柑橘粉蚧(桔粉蚧(*Planococcus citri* Risso))；其他粉蚧複合(*Pseudococcus* spp.) (其他粉蚧複合)；梨木虱(*Cacopsylla pyricola* Foerster)、柿木虱(*Trioza diospyri* Ashmead)。

【0275】 本發明之化合物亦對半翅目成員具有活性，該等成員包括：綠椿象(*Acrosternum hilare* Say)、南瓜緣蝽(*Anasa tristis* De Geer)、高粱長蝽(*Blissus leucopterus leucopterus* Say)、床蝨(*Cimex lectularius* Linnaeus)、棉網蝽(*Corythuca gossypii* Fabricius)、番茄蝽(*Cyrtopeltis modesta* Distant)、棉蝽象(*Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer)、褐椿象(*Euchistus servus* Say)、單點椿象(*Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois)、長蝽系群(*Graptosthetus* spp.)、茶翅椿臭蟲(*Halymorpha halys* Stål)、葉足松種子蟲(*Leptoglossus corculus* Say)、牧草盲蝽(*Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois)、南方綠臭蟲(*Nezara viridula* Linnaeus)、稻臭蟲(*Oebalus pugnax* Fabricius)、大乳草蝽(*Oncopeltus fasciatus* Dallas)、棉跳盲蝽(*Pseudatomoscelis seriatus* Reuter)。經本發明之化合物防治之其他昆蟲目包括纓翅目(Thysanoptera)(例如：西方花薊馬(*Frankliniella occidentalis* Pergande (western flower thrips))、柑橘薊馬(*Scirtothrips citri* Moulton (citrus thrips))、黃豆薊馬(*Sericothrips variabilis* Beach (soybean thrips))及蔥薊馬(*Thrips tabaci* Lindeman (onion thrips))；及鞘翅目(Coleoptera)(例如：馬鈴薯甲蟲(*Leptinotarsa decemlineata* Say (科羅拉多馬鈴薯甲蟲))、墨西哥豆瓢(*Epilachna varivestis* Mulsant (墨西哥豆甲蟲))及叩甲屬(*Agriotes*)、山叩甲屬(*Athous*)或金針蟲屬(*Limonius*)之線蟲。

【0276】 注意當代一些分類系統將同翅目(Homoptera)歸為半翅目(Hemiptera)下之亞目。

【0277】 值得注意的是本發明化合物用於防治西方花薊馬 (*Frankliniella occidentalis*) 之用途。值得注意的為本發明之化合物用於防治馬鈴薯葉蟬 (馬鈴薯小綠葉蟬) (*Empoasca fabae*) 之用途。值得注意的為本發明之化合物用於防治棉瓜蚜 (棉蚜 (*Aphis gossypii*)) 之用途。值得注意的為本發明之化合物用於防治綠桃蚜 (桃蚜 (*Myzus persicae*)) 之用途。值得注意的是本發明之化合物用於防治甘薯粉虱 (*Bemisia tabaci*) 之用途。

【0278】 本發明之化合物亦可能可用於增加一作物植物之活力。該方法包含接觸作物植物 (例如：葉子、花、果實或根部) 或是長出該作物植物之種子與足以達成所欲植物活力功效之量 (即生物有效量) 之式 1 化合物。一般而言，式 1 化合物係以配製好的組成物施用。雖然式 1 化合物通常直接施用至作物植物或其種子，其也可被施用至該作物植物之所在地，亦即該作物植物之環境，特別是足夠鄰近以至於能讓式 1 化合物移動至該作物植物的環境部份。與本方法有關之該所在地最常包含生長介質 (即提供營養給植物的介質)，通常為植物生長於其中的土壤。因此，增加作物植物活力的作物植物處理包含接觸該作物植物、長出該作物植物之種子或該作物植物之所在地與生物有效量之式 1 化合物。

【0279】 增加作物活力可導致一或多種下列觀察到之功效：(a) 使作物發育最佳化，如由極佳之種子萌芽、作物萌發與作物挺立所展現者；(b) 增進作物生長，如由快速強健之葉片生長 (例如，由葉面積指數所測量者)、植物高度、分蘗數目 (例如，稻米)、根部質量與

作物營養體之整體乾重所展現者；(c)改善作物生產力，如由開花時間、開花期長短、花數目、總生質累積量（即生產量）及/或農產品的水果或穀物銷售等級（即生產品質）；(d)增進作物承受或預防植物疾病感染與節肢動物、線蟲或軟體動物害蟲侵染的能力；以及(e)提高作物承受環境壓力的能力，環境壓力諸如曝露於極端溫度、次最佳水分狀況或植物毒性化學品。

**【0280】** 本發明之化合物可藉由殺滅植食性無脊椎動物害蟲或以其他方式防止植食性無脊椎動物害蟲在植物環境中攝食，從而使經處理植物比未經處理植物更具活力。若未如上述防治植食性無脊椎動物害蟲，害蟲會吃掉植物組織或汁液，或傳播植物病原體（如病毒）而減少植物活力。即使沒有植食性無脊椎動物害蟲存在，本發明之化合物可藉由調節植物的代謝來增加植物活力。一般來說，如果該植物係生長在不理想的環境中，藉由以本發明化合物處理該植物將使作物植物之活力最顯著地增加，所謂不理想的環境是指包含一或多種不利於該植物達成若在理想環境中將可展現的完整遺傳潛力的面向的環境。

**【0281】** 值得注意的是一種用於增加一作物植物之活力的方法，其中該作物植物係生長在一包含植食性無脊椎動物害蟲的環境中。亦值得注意的是一種用於增加一作物植物之活力的方法，其中該作物植物係生長在一未包含植食性無脊椎動物害蟲的環境中。亦值得注意的是一種用於增加一作物植物之活力的方法，其中該作物植物係生長在所包含的水分量低於支持該作物植物生長之理想水分量的環境中。值得注意的是一種用於增加一作物植物之活力的方法，其中該作物植物

為稻米。亦值得注意的是一種用於增加一作物植物之活力的方法，其中該作物植物為玉米。亦值得注意的是一種用於增加一作物植物之活力的方法，其中該作物植物為大豆。

**【0282】** 也可將本發明化合物與一或多種其他具有生物活性的化合物或藥劑混合，以形成一多成分殺蟲劑，提供更廣泛的農業及非農業利用範圍，該化合物或藥劑包括殺蟲劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、殺菌劑、殺蟎劑、除草劑、除草劑解毒劑、生長調節劑如昆蟲蛻皮抑制劑及生根劑 (rooting stimulants)、化學滅菌劑、化學傳訊物質 (semiochemicals)、驅蟲劑 (repellents)、引誘劑、費洛蒙、激食因子 (feeding stimulants)、其他具有生物活性的化合物或蟲生病原細菌、病毒或真菌。因此本發明亦關於一種組成物，其包含一生物有效量的一式 **1** 化合物、至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑與液體稀釋劑所組成之群組的額外組分，以及至少一種額外生物活性化合物或藥劑。關於本發明混合物，可將其他具有生物活性的化合物或藥劑與本發明之化合物（包括式 **1** 化合物）一起配製，以形成一預混物，或該其他具有生物活性的化合物或藥劑可與本發明之化合物（包括式 **1** 化合物）分開配製，並在施用前將二種配方組合在一起（例如，在一噴灑槽中），或者接替施用二種配方。

**【0283】** 可與本發明之化合物一起配製的此類生物活性化合物或藥劑之實例為殺蟲劑，諸如阿巴汀 ( abamectin )、毆殺松 ( acephate )、亞醜蟎 ( acequinocyl )、亞滅培 ( acetamiprid )、阿納寧 ( acrinathrin )、afidopyropen

( [(3*S*,4*R*,4*aR*,6*S*,6*aS*,12*R*,12*aS*,12*bS*)-3-[(環丙羰基)氧基]-1,3,4,4*a*,5,6,6*a*,12,12*a*,12*b*-十氫-6,12-二羥基-4,6*a*,12*b*-三甲基-11-側氧基-9-(3-吡啶基)-2*H*,11*H*-萘并[2,1-*b*]哌喃并[3,4-*e*]哌喃-4-基]環丙烷甲酸甲酯)、磺胺蟎酯 (amidoflumet)、三亞蹠 (amitraz)、阿維菌素 (avermectin)、印楝素 (azadirachtin)、谷速松 (azinphos-methyl)、免扶克 (benfuracarb)、免速達 (bensultap)、畢芬寧 (bifenthrin)、聯苯胼酯 (bifenazate)、雙三氟蟲脲 (bistrifluron)、硼酸鹽 (borate)、布芬淨 (buprofezin)、硫線磷 (cadusafos)、加保利 (carbaryl)、加保扶 (carbofuran)、培丹 (cartap)、酸酯蟎 (carzol)、剋安勃 (chlorantraniliprole)、克凡派 (chlorfenapyr)、克福隆 (chlorfluazuron)、陶斯松 (chlorpyrifos)、甲基陶斯松 (chlorpyrifos-methyl)、可芬諾 (chromafenozide)、克芬蟎 (clofentezin)、可尼丁 (clothianidin)、氰特破 (cyantraniliprole) (3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-*N*-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡啶-5-甲醯胺)、cyclaniliprole (3-溴-*N*-[2-溴-4-氯-6-[[1-環丙基乙基)胺基]羰基]苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡啶-5-甲醯胺)、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、環氧蟲啉(cycloxaprid) ((5*S*,8*R*)-1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2,3,5,6,7,8-六氫-9-硝基-5,8-環氧-1*H*-咪啶并[1,2-*a*]氮呋)、賽芬蟎 (cyflumetofen)、賽扶寧 (cyfluthrin)、貝塔賽扶寧 (beta-cyfluthrin)、賽洛寧 (cyhalothrin)、伽瑪賽洛寧 (gamma-cyhalothrin)、拉目達賽洛寧

( lambda-cyhalothrin ) 、賽滅寧 ( cypermethrin ) 、亞滅寧 ( alpha-cypermethrin ) 、傑他賽滅寧 ( zeta-cypermethrin ) 、賽滅淨 ( cyromazine ) 、第滅寧 ( deltamethrin ) 、汰芬隆 ( diafenthiuron ) 、大利松 ( diazinon ) 、地特靈 ( dieldrin ) 、二福隆 ( diflubenzuron ) 、四氟甲醚菊酯 ( dimefluthrin ) 、殺蟲雙 ( dimehypo ) 、大滅松 ( dimethoate ) 、達特南 ( dinotefuran ) 、苯蟲醚 ( diofenolan ) 、因滅汀 ( emamectin ) 、安殺番 ( endosulfan ) 、益化利 ( esfenvalerate ) 、乙蟲清 ( ethiprole ) 、依芬寧 ( etofenprox ) 、依殺蟎 ( etoxazole ) 、芬佈賜 ( fenbutatin oxide ) 、撲滅松 ( fenitrothion ) 、芬硫克 ( fenothiocarb ) 、芬諾克 ( fenoxycarb ) 、芬普寧 ( fenpropathrin ) 、芬化利 ( fenvalerate ) 、芬普尼 ( fipronil ) 、flometoquin ( 2-乙基-3,7-二甲基-6-[4-(三氟甲氧基)苯氧基]-4-喹啉基碳酸甲酯 ) 、氟尼胺 ( flonicamid ) 、氟蟲醯胺 ( flubendiamide ) 、護賽寧 ( flucythrinate ) 、嘍蟲胺 ( flufenerim ) 、氟芬隆 ( flufenoxuron ) 、氟菌蟎酯 ( flufenoxystrobin ) ( (αE)-2-[[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]甲基]-α-(甲氧基亞甲基)苯乙酸甲酯 ) 、flufensulfone ( 5-氯-2-[(3,4,4-三氟-3-丁烯-1-基)磺醯基]噻唑 ) 、fluhexafon 、氟吡菌醯胺 ( fluopyram ) 、flupiprole ( 1-[2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基]-5-[(2-甲基-2-丙烯-1-基)胺基]-4-[(三氟甲基)亞磺醯基]-1H-吡唑-3-羰腈 ) 、弗盧皮拉蒂 ( flupyradifurone ) ( 4-[[[(6-氯-3-吡啶基)甲基](2,2-二氟乙基)胺基]-2(5H)-呋喃酮 ) 、福化利 ( fluvalinate ) 、τ-福化利

(tau-fluvalinate)、大福松 (fonophos)、覆滅蟎 (formetanate)、福賽絕 (fosthiazate)、合芬隆 (halofenozide)、氯氟醚菊酯 (heptafluthrin) (2,2-二甲基-3-[(1Z)-3,3,3-三氟-1-丙烯-1-基]環丙烷甲酸 [2,3,5,6-四氟-4-(甲氧甲基)苯基]甲酯)、六伏隆 (hexaflumuron)、合賽多 (hexythiazox)、愛美松 (hydramethylnon)、益達胺 (imidacloprid)、因得克 (indoxacarb)、殺蟲肥皂 (insecticidal soaps)、亞芬松 (isofenphos)、祿芬隆 (lufenuron)、馬拉松 (malathion)、氯氟醚菊酯 (meperfluthrin) ((1R,3S)-3-(2,2-二氯乙基)-2,2-二甲基環丙烷甲酸 [2,3,5,6-四氟-4-(甲氧甲基)苯基]甲酯)、美氟綜 (metaflumizone)、滅蝸靈 (metaldehyde)、達馬松 (methamidophos)、滅大松 (methidathion)、滅賜克 (methiodicarb)、納乃得 (methomyl)、美賜平 (methoprene)、甲氧 DDT (methoxychlor)、美特寧 (metofluthrin)、滅芬諾 (methoxyfenozide)、美特寧 (metofluthrin)、亞素靈 (monocrotophos)、monofluorothrin (3-(2-氰基-1-丙烯-1-基)-2,2-二甲基環丙烷甲酸 [2,3,5,6-四氟-4-(甲氧甲基)苯基]甲酯)、菸鹼 (nicotine)、烯啶蟲胺 (nitenpyram)、尼殺賽 (nithiazine)、諾伐隆 (novaluron)、諾伏隆 (noviflumuron)、毆殺滅 (oxamyl)、巴拉松 (parathion)、甲基巴拉松 (parathion-methyl)、百滅寧 (permethrin)、福瑞松 (phorate)、裕必松 (phosalone)、益滅松 (phosmet)、福賜米松 (phosphamidon)、比加普 (pirimicarb)、



佈飛松 ( profenofos ) 、 佈福靈 ( profluthrin ) 、 毆蟎多  
 ( propargite ) 、 佈芬佈 ( protrifenbute ) 、 pyflubumide ( 1,3,5-三甲  
 基-*N*-(2-甲基-1-側氧丙基)-*N*-[3-(2-甲基丙基)-4-[2,2,2-三氟-1-甲氧基-  
 1-(三氟甲基)乙基]苯基]-1*H*-吡啶-4-甲醯胺 ) 、 派滅淨  
 ( pymetrozine ) 、 派福羅 ( pyrafluprole ) 、 除蟲菊精 ( pyrethrin ) 、  
 畢達本 ( pyridaben ) 、 啖蟲丙醚 ( pyridalyl ) 、 披福貴  
 ( pyrifluquinazon ) 、 嘧蟎胺 ( pyriminostrobin ) ( ( $\alpha E$ )-2-[[[2-[(2,4-  
 二氯苯基)胺基]-6-(三氟甲基)-4-嘧啶基]氧基]甲基]- $\alpha$ -(甲氧基亞甲基)  
 苯乙酸甲基酯 ) 、 披綠羅 ( pyriprole ) 、 百利普芬 ( pyriproxifen ) 、  
 魚藤精 ( rotenone ) 、 阿諾鹼 ( ryanodine ) 、 矽護芬 ( silafluofen ) 、  
 賜托拉 ( spinetoram ) 、 賜諾殺 ( spinosad ) 、 賜派芬  
 ( spirodiclofen ) 、 螺甲蟎酯 ( spiromesifen ) 、 螺蟲乙酯  
 ( spirotetramat ) 、 甲丙硫磷 ( sulprofos ) 、 賜殺羅 ( sulfoxaflor )  
 ( *N*-[甲基氧負離子基[1-[6-(三氟甲基)-3-吡啶基]乙基]- $\lambda^4$ -亞巰基]氰  
 胺 ) 、 得芬諾 ( tebufenozide ) 、 得芬瑞 ( tebufenpyrad ) 、 得福  
 ( teflubenzuron ) 、 七氟菊酯 ( tefluthrin ) 、 托福松 ( terbufos ) 、 殺  
 蟲畏 ( tetrachlorvinphos ) 、 治滅寧 ( tetramethrin ) 、 四甲氟菊酯  
 ( tetramethylfluthrin ) ( 2,2,3,3-四甲基環丙烷甲酸[2,3,5,6-四氟-4-  
 (甲氧甲基)苯基]甲酯 ) 、 tetraniliprole 、 賽果培 ( thiacloprid ) 、 賽速  
 安 ( thiamethoxam ) 、 硫敵克 ( thiodicarb ) 、 殺蟲單 ( thiosultap-  
 sodium ) 、 tioxazafen ( 3-苯基-5-(2-噻吩基)-1,2,4-【□+罈】二  
 唑 ) 、 脫芬瑞 ( tolfenpyrad ) 、 泰滅寧 ( tralomethrin ) 、 啞蚜威

( triazamate ) 、三氯松 ( trichlorfon ) 、triflumezopyrim ( 2,4-二側氧基-1-(5-嘧啶甲基)-3-[3-(三氟甲基)苯基]-2*H*-吡啶并[1,2-*a*]嘧啶內鹽 ) 、三福隆 ( triflumuron ) 、蘇力菌德他內毒素 ( *Bacillus thuringiensis* delta-endotoxins ) 、蟲生病原細菌、蟲生病原病毒與蟲生病原真菌。

【0284】 值得注意的是殺蟲劑，如阿巴汀、亞滅培、阿納寧、afidopyropen、三亞蹠、阿維菌素、印棟素、免扶克、免速達、畢芬寧、布芬淨、硫線磷、加保利、培丹、剋安勃、克凡派、陶斯松、可尼丁、氰特破、cyclaniliprole、乙氰菊酯、賽扶寧、貝塔賽扶寧、賽洛寧、伽瑪賽洛寧、拉目達賽洛寧、賽滅寧、亞滅寧、傑他賽滅寧、賽滅淨、第滅寧、地特靈、達特南、苯蟲醚、因滅汀、安殺番、益化利、乙蟲清、依芬寧、依殺蟎、撲滅松、芬硫克、芬諾克、芬化利、芬普尼、flometoquin、氟尼胺、氟蟲醯胺、氟芬隆、氟菌蟎酯 (flufenoxystrobin)、flufensulfone、flupiprole、弗盧皮拉蒂 (flupyradifurone)、福化利、覆滅蟎、福賽絕、氯氟醚菊酯 (heptafluthrin)、六伏隆、愛美松、益達胺、因得克、祿芬隆、氯氟醚菊酯、美氟綜、滅賜克、納乃得、美賜平、滅芬諾、美特寧、monofluorothrin、烯啶蟲胺、尼殺賽、諾伐隆、毆殺滅、pyflubumide、派滅淨、除蟲菊精、畢達本、啶蟲丙醚、啞蟎胺、百利普芬、阿諾鹼、賜托拉、賜諾殺、賜派芬、螺甲蟎酯、螺蟲乙酯、賜殺羅、得芬諾、治滅寧、四甲氟菊酯、賽果培、賽速安、硫敵克、殺蟲單、泰滅寧、啞蚜威、triflumezopyrim、三福隆、蘇力菌德他內毒

素、所有蘇力菌之品系與所有核多角體病（nucleo polyhedrosis）病毒之品系。

【0285】 用於與本發明之化合物混合的一個生物藥劑實施例包含蟲生病原細菌如蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)以及經微膠囊化之蘇力菌德他內毒素，如 MVP<sup>®</sup>與 MVPII<sup>®</sup>生物殺蟲劑，其係以 CellCap<sup>®</sup>製程製備而得（CellCap<sup>®</sup>、MVP<sup>®</sup>與 MVPII<sup>®</sup>皆為 Mycogen Corporation, Indianapolis, Indiana, USA 之商標）；蟲生病原真菌（entomopathogenic fungi），如綠蠶黴菌（green muscardine fungus）；及蟲生病原病毒（包含自然發生及基因改良兩種），包含桿狀病毒、核多角體病毒（nucleopolyhedro virus (NPV)），如：棉鈴蟲核多角體病毒(*Helicoverpa zea nucleopolyhedrovirus (HzNPV)*)、芹菜夜蛾核多角體病毒(*Anagrapha falcifera nucleopolyhedrovirus (AfNPV)*)；及顆粒體病毒(GV)，如蘋果蠹蛾顆粒體病毒(*Cydia pomonella granulosis virus (CpGV)*)。

【0286】 特別注意的是此種組合，其中其他無脊椎動物害蟲之防治活性成分屬於不同於式 1 化合物之化學類別或有不同之作用位點。在某些實例中，與至少一種其他具有相似防治範圍但不同作用位點之防治無脊椎動物害蟲的活性成分的組合將特別有利於抗藥性管理。因此，本發明之組成物可進一步包含生物有效量之至少一種其他無脊椎動物害蟲防治活性成分，其有相似防治範圍但屬於不同化學類別或有不同之作用位點。這些額外生物活性化合物或藥劑包括但不限於乙醯膽鹼酯酶(AChE)抑制劑，如胺基甲酸酯類之納乃得、毆殺滅、硫敵

克、啞蚜威，以及有機磷酸酯類之陶斯松；GABA-閘控氯離子通道拮抗劑，如環二烯類之地特靈與安殺番，以及苯吡啶類之乙蟲清與芬普尼；鈉離子通道調節劑如擬除蟲菊酯類之畢芬寧、賽扶寧、貝塔賽扶寧、賽洛寧、拉目達賽洛寧、賽滅寧、第滅寧、四氟甲醚菊酯、益化利、美特寧與佈福靈；菸鹼乙醯膽鹼受體 (nicotinic acetylcholinereceptor, nAChR) 促效劑如新菸鹼類之亞滅培、可尼丁、達特南、益達胺、烯啶蟲胺、尼殺賽、賽果培與賽速安，以及賜殺羅；菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)別構活化物(allosteric activator)如賜諾司類(spinosyn)之賜托拉與賜諾殺；氯離子通道活化劑如阿維菌素類之阿巴汀與因滅汀；青春激素擬似物如苯蟲醚、美賜平、芬諾克與百利普芬；選擇性同翅昆蟲(homopteran)攝食阻斷劑如派滅淨與氟尼胺；蟎生長抑制劑如依殺蟎；粒線體 ATP 合成酶抑制劑如毆蟎多；氧化磷酸化解偶聯劑（經由干擾質子梯度）如克凡派；菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)通道阻斷劑如沙蠶毒素同功異質體之培丹；殼糖生物合成抑制劑如苯甲醯脲類之氟芬隆、六伏隆、祿芬隆、諾伐隆、諾伏隆與三福隆，以及布芬淨；雙翅類昆蟲蛻皮干擾劑(dipteran moulting disrupter)如賽滅淨；蛻皮激素受體促效劑如二醯肼類之滅芬諾與得芬諾；章魚胺受體促效劑如三亞蹠；粒線體複合體 III 電子傳輸抑制劑如愛美松；粒線體複合體 I 電子傳輸抑制劑如畢達本；電壓依賴型鈉離子通道阻斷劑如因得克；乙醯 CoA 羧化酶抑制劑如特窗酸與帖啞咪酸類(tetronic and tetramic acids)之賜派芬、螺甲蟎酯與螺蟲乙酯；粒線體複合體 II 電子傳輸抑制劑如  $\beta$ -酮腈類之 cyenopyrafen 與賽芬蟎；阿

諾鹼受體(ryanodine receptor)調節劑如鄰胺苯甲二醯胺類(剋安勃、氰特破與氰特破)、二醯胺類(如氟蟲醯胺)以及阿諾鹼受體配體(如阿諾鹼);負責生物活性之目標位點未知或未特徵化之化合物,諸如印棟素、聯苯肼酯、啞蟲丙醚、披福貴與 triflumezopyrim;昆蟲中腸膜微生物干擾劑如蘇力菌(*Bacillus thuringensis*)與其產生之德他內毒素及球形芽孢桿菌(*Bacillus sphaericus*);以及包括核多角體病毒(NPV)與其他天然出現或基因改造之殺蟲病毒的生物劑。

【0287】可與本發明化合物一起配製之生物活性化合物或藥劑的進一步實例為:殺真菌劑如阿拉酸式苯-S-甲基(acibenzolar-S-methyl)、愛地福(aldimorph)、辛啞啞菌胺(ametoctradin)、吡啶啞菌胺(amisulbrom)、敵菌靈(anilazine)、阿扎康啞(azaconazole)、亞托敏(azoxystrobin)、本達樂(benalaxyl,包括本達樂-M)、麥鏽靈(benodanil)、免賴得(benomyl)、苯噁菌胺(benthiavalicarb,包括苯噁菌胺-異丙基)、苯并烯氟菌啞(benzovindiflupyr)、比托沙(bethoxazin)、百蟻克(binapacryl)、聯苯(biphenyl)、比多農(bitertanol)、必殺芬(bixafen)、保米黴素(blasticidin-S)、白克列(boscalid)、溴克座(bromuconazole)、布瑞莫(bupirimate)、得滅多(buthiobate)、菱鏽靈(carboxin)、加普胺(carpropamid)、四氯丹(captafol)、蓋普丹(captan)、貝芬替(carbendazim)、地茂散(chloroneb)、四氯異苯腈(chlorothalonil)、克氯得(chlozolinate)、氫氧化銅、氯氧化銅、硫酸銅、丁香菌酯

( coumoxystrobin ) 、 賽 座 滅 ( cyazofamid ) 、 賽 芬 胺 ( cyflufenamid ) 、 克 絕 ( cymoxanil ) 、 環 克 座 ( cyproconazole ) 、 賽 普 洛 ( cyprodinil ) 、 益 發 靈 ( dichlofluanid ) 、 雙 氯 氰 菌 胺 ( diclocymet ) 、 達 滅 淨 ( diclomezine ) 、 氯 硝 胺 ( dicloran ) 、 乙 霉 威 ( diethofencarb ) 、 待 克 利 ( difenoconazole ) 、 二 氟 林 ( diflumetorim ) 、 二 甲 依 瑞 莫 ( dimethirimol ) 、 達 滅 芬 ( dimethomorph ) 、 醚 菌 胺 ( dimoxystrobin ) 、 達 克 利 ( diniconazole , 包 括 達 克 利 --M ) 、 白 粉 克 ( dinocap ) 、 腈 硫 醌 ( dithianon ) 、 二 硫 【 口 + 東 】 ( dithiolanes ) 、 十 二 環 嗎 啉 ( dodemorph ) 、 多 寧 ( dodine ) 、 益 康 唑 ( econazole ) 、 乙 環 唑 ( etaconazole ) 、 護 粒 松 ( edifenphos ) 、 烯 肱 菌 酯 ( enoxastrobin ) ( 亦 已 知 為 烯 肱 菌 酯 ( enestroburin ) ) 、 依 普 座 ( epoxiconazole ) 、 噁 唑 菌 胺 ( ethaboxam ) 、 依 瑞 莫 ( ethirimol ) 、 依 得 利 ( etridiazole ) 、 凡 殺 同 ( famoxadone ) 、 咪 唑 菌 酮 ( fenamidone ) 、 烯 肱 菌 胺 ( fenaminstrobin ) 、 芬 瑞 莫 ( fenarimol ) 、 芬 克 座 ( fenbuconazole ) 、 甲 呋 醯 胺 ( fenfuram ) 、 環 醯 菌 胺 ( fenhexamide ) 、 氰 菌 胺 ( fenoxanil ) 、 拌 種 咯 ( feniclonil ) 、 苯 鏽 啞 ( fenpropidin ) 、 芬 普 福 ( fenpropimorph ) 、 胺 苯 吡 菌 酮 ( fenpyrazamine ) 、 三 苯 醋 錫 ( fentin acetate ) 、 三 苯 羥 錫 ( fentin hydroxide ) 、 富 爾 邦 ( ferbam ) 、 富 米 綜 ( ferimzone ) 、 flometoquin 、 扶 吉 胺 ( fluazinam ) 、 護 汰 寧 ( fludioxonil ) 、 氟 菌 蟎 酯

( flufenoxystrobin ) 、 氟 嗎 啉 ( flumorph ) 、 氟 比 來 ( fluopicolide ) 、 氟 吡 菌 醯 胺 ( fluopyram ) 、 氟 嘧 菌 酯 ( fluoxastrobin ) 、 氟 喹 啉 ( fluquinconazole ) 、 護 矽 得 ( flusilazole ) 、 氟 硫 滅 ( flusulfamide ) 、 氟 噻 菌 淨 ( flutianil ) 、 福 多 寧 ( flutolanil ) 、 護 汰 芬 ( flutriafol ) 、 氟 苯 吡 菌 胺 ( fluxapyroxad ) 、 福 爾 培 ( folpet ) 、 熱 必 斯 ( fthalide , 亦 稱 為 phthalide ) 、 麥 穗 寧 ( fuberidazole ) 、 呋 霜 靈 ( furalaxyl ) 、 福 拉 比 ( furametpyr ) 、 菲 克 利 ( hexaconazole ) 、 殺 紋 寧 ( hymexazole ) 、 克 熱 淨 ( guazatine ) 、 依 滅 列 ( imazalil ) 、 易 胺 座 ( imibenconazole ) 、 克 熱 淨 烷 苯 磺 酸 鹽 ( iminoctadine albesilate ) 、 克 熱 淨 三 乙 酸 鹽 ( iminoctadine triacetate ) 、 碘 菌 威 ( iodcarb ) 、 種 菌 啞 ( ipconazole ) 、 isofetamid 、 丙 基 喜 樂 松 ( iprobenfos ) 、 依 普 同 ( iprodione ) 、 丙 森 鋅 ( iprovalicarb ) 、 亞 賜 圃 ( isoprothiolane ) 、 吡 啞 萘 菌 胺 ( isopyrazam ) 、 異 噻 菌 胺 ( isotianil ) 、 嘉 賜 黴 素 ( kasugamycin ) 、 克 收 欣 ( kresoxim-methyl ) 、 鋅 錳 乃 浦 ( mancozeb ) 、 雙 炔 醯 菌 胺 ( mandipropamid ) 、 mandestrobin 、 錳 乃 浦 ( maneb ) 、 滅 派 林 ( mapanipyrin ) 、 滅 普 寧 ( mepronil ) 、 氧 乙 酸 基 白 粉 克 ( meptyldinocap ) 、 滅 達 樂 ( metalaxyl , 包 括 滅 達 樂 -M/ 右 滅 達 樂 ) 、 滅 特 座 ( metconazole ) 、 滅 速 克 ( methasulfocarb ) 、 免 得 爛 ( metiram ) 、 苯 氧 菌 胺 ( metominostrobin ) 、 滅 芬 農 ( metrafenone ) 、 邁 克 尼 ( myclobutanil ) 、 萘 替 芬 ( naftitine ) 、 新

阿蘇仁 (neo-asozin, 鐵甲砷酸銨)、氟苯嘧啶醇 (nuarimol)、辛噁酮 (octhilinone)、呋醯胺 (ofurace)、肱醚菌胺 (orysastrobin)、噁唑烷酮 (oxadixyl)、oxathiapiprolin、噁啞酸 (oxolinic acid)、噁咪唑 (oxpoconazole)、嘉保信 (oxycarboxin)、土黴素 (oxytetracycline)、戊菌唑 (penconazole)、戊菌隆 (pencycuron)、氟唑菌苯胺 (penflufen)、吡噁菌胺 (penthioapyrad)、稻瘋酯 (perfurazoate)、亞磷酸 (包括其鹽, 例如福賽得 (fosetyl-aluminum))、啞氧菌酯 (picoxystrobin)、粉病靈 (piperalin)、多氧菌素 (polyoxin)、撲殺熱 (probenazole)、撲克拉 (prochloraz)、撲滅寧 (procymidone)、普拔克 (propamocarb)、普克利 (propiconazole)、甲基鋅乃浦 (propineb)、丙氧啞啞 (proquinazid)、胺丙威 (prothiocarb)、丙硫菌唑 (prothioconazole)、百克敏 (pyraclostrobin)、啞胺菌酯 (pyrametostrobin)、啞菌酯 (pyraoxystrobin)、白粉松 (pyrazophos)、防霉丹 (pyribencarb)、pyributacarb、比芬諾 (pyrifenoxy)、派芬農 (pyriofenone)、perisoxazole、派美尼 (pyrimethanil)、比芬諾 (pyrifenoxy)、吡咯菌素 (pyrrolnitrin)、百快隆 (pyroquilon)、奎因克座 (quinconazole)、quinmethionate、快諾芬 (quinoxifen)、五氯硝基苯 (quintozene)、矽噁菌胺 (silthiofam)、環丙吡菌胺 (sedaxane)、矽氟唑 (simeconazole)、萁孢菌素 (spiroxamine)、鏈黴素 (streptomycin)、硫、得克利



( tebuconazole ) 、 泰 伏 勤 ( tebufloquin ) 、 克 枯 爛 ( teclofthalam ) 、 克 枯 爛 ( tecloftalam ) 、 四 氯 硝 基 苯 ( tecnazene ) 、 特 比 萘 酚 ( terbinafine ) 、 四 克 利 ( tetraconazole ) 、 腐 絕 ( thiabendazole ) 、 賽 氟 滅 ( thifluzamide ) 、 多 保 淨 ( thiophanate ) 、 甲 基 多 保 淨 ( thiophanate-methyl ) 、 得 恩 地 ( thiram ) 、 噻 醯 菌 胺 ( tiadinil ) 、 脫 克 松 ( tolclofos-methyl ) 、 托 普 羅 卡 布 ( tolprocarb ) 、 基 益 發 靈 ( tolyfluanid ) 、 三 泰 芬 ( triadimefon ) 、 甲 三 泰 隆 ( triadimenol ) 、 嘧 菌 醇 ( triarimol ) 、 咪 唑 嗪 ( triazoxide ) 、 三 元 硫 酸 銅 ( tribasic copper sulfate ) 、 triclopyricarb 、 三 得 芬 ( tridemorph ) 、 三 氟 敏 ( trifloxystrobin ) 、 賽 福 座 ( triflumizole ) 、 trimoprhamide 、 三 賽 唑 ( tricyclazole ) 、 三 氟 敏 ( trifloxystrobin ) 、 賽 福 寧 ( triforine ) 、 滅 菌 唑 ( triticonazole ) 、 單 克 素 ( uniconazole ) 、 維 利 黴 素 ( validamycin ) 、 瓦 芬 耐 ( valifenalate , 亦 稱 為 valifenal ) 、 免 克 寧 ( vinclozolin ) 、 鋅 乃 浦 ( zineb ) 、 福 美 鋅 ( ziram ) 、 座 賽 胺 ( zoxamide ) 與 1-[4-[4-[5-(2,6-二 氟 苯 基)-4,5-二 氫-3-異 喹 啉 基]-2-噻 唑 基]-1-哌 啶 基]-2-[5-甲 基-3-(三 氟 甲 基)-1*H*-吡 啶-1-基]乙 酮 ; 殺 線 蟲 劑 如 氟 吡 菌 醯 胺 ( fluopyram ) 、 螺 蟲 乙 酯 ( spirotetramat ) 、 硫 敵 克 ( thiodicarb ) 、 福 賽 絕 ( fosthiazate ) 、 阿 巴 汀 ( abamectin ) 、 依 普 同 ( iprodione ) 、 氟 噻 蟲 磺 ( fluensulfone ) 、 二 硫 化 二 甲 基 、 tioxazafen 、 1,3-二 氯 丙 烯 (1,3-D) 、 威 百 敏 ( metam ) ( 鈉 與 鉀 鹽 ) 、 邁 隆 ( dazomet ) 、 三 氯 硝 基 甲

烷 ( chloropicrin ) 、 芬 滅 松 ( fenamiphos ) 、 普 伏 松 ( ethoprophos ) 、 加 奪 松 ( cadusaphos ) 、 托 福 松 ( terbufos ) 、 新 煙 鹼 類 ( imicyafos ) 、 毆 殺 滅 ( oxamyl ) 、 加 保 扶 ( carbofuran ) 、 tioxazafen 、 強 固 芽 胞 桿 菌 ( *Bacillus firmus* ) 及 巴 斯 德 芽 菌 ( *Pasteuria nishizawae* ) ； 殺 菌 劑 如 鏈 黴 素 ； 殺 蟎 劑 ， 如 三 亞 蹠 ( amitraz ) 、 蟎 離 丹 ( chinomethionat ) 、 克 氯 苯 ( chlorobenzilate ) 、 錫 蟎 丹 ( cyhexatin ) 、 大 克 蟎 ( dicofol ) 、 得 氯 蟎 ( dienochlor ) 、 依 殺 蟎 ( etoxazole ) 、 芬 殺 蟎 ( fenazaquin ) 、 芬 佈 賜 ( fenbutatin oxide ) 、 芬 普 寧 ( fenpropathrin ) 、 芬 普 蟎 ( fenpyroximate ) 、 合 賽 多 ( hexythiazox ) 、 毆 蟎 多 ( propargite ) 、 畢 達 本 ( pyridaben ) 及 得 芬 瑞 ( tebufenpyrad ) 。

**【0288】** 在 一 些 實 例 中 ， 本 發 明 化 合 物 與 其 他 生 物 活 性 ( 特 別 是 具 無 脊 椎 動 物 害 蟲 防 治 活 性 ) 化 合 物 或 藥 劑 ( 即 活 性 成 分 ) 的 組 合 可 造 成 大 於 相 加 ( 即 協 同 ) 的 效 果 。 降 低 活 性 成 分 的 環 境 排 放 量 同 時 確 保 有 效 之 害 蟲 防 治 效 果 一 直 是 所 欲 的 。 當 無 脊 椎 害 蟲 防 治 活 性 成 分 的 協 同 作 用 發 生 於 能 展 現 農 藝 上 滿 意 程 度 之 無 脊 椎 動 物 害 蟲 防 治 的 施 用 比 例 ， 此 類 組 合 可 有 利 於 減 少 作 物 生 產 成 本 及 降 低 環 境 負 擔 。

**【0289】** 本 發 明 化 合 物 及 其 組 成 物 可 施 用 於 經 過 基 因 轉 殖 以 表 現 對 無 脊 椎 動 物 害 蟲 有 毒 的 蛋 白 ( 如 蘇 力 菌 德 他 內 毒 素 (*Bacillus thuringiensis* delta-endotoxins) ) 之 植 物 。 該 施 用 可 提 供 更 大 範 圍 的 植 物 保 護 ， 並 且 有 利 於 抗 藥 性 管 理 。 從 外 部 施 用 的 本 發 明 無 脊 椎 動 物 害 蟲 防 治 化 合 物 之 效 果 可 能 與 該 經 表 現 的 毒 蛋 白 產 生 協 同 作 用 。

【0290】 這些農業保護劑（即殺蟲劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、殺蟎劑、除草劑及生物藥劑）的一般參考文獻包括 *The Pesticide Manual, 13th Edition*, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 以及 *The BioPesticide Manual, 2<sup>nd</sup> Edition*, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001。

【0291】 對於其中使用一或多種這些各式混合伙伴藥劑的實施例而言，這些各式混合伙伴藥劑（總計）對式 1 化合物之重量比例典型為介於約 1:3000 至約 3000:1。值得注意的是介於約 1:300 至約 300:1 之間之重量比例（例如介於約 1:30 至約 30:1 之間的比例）。精於此技藝人士可經由簡單實驗，輕易決定達成所欲生物活性範圍所需之活性成分的生物有效量。顯而易見地是，包含這些額外組分可擴展無脊椎動物害蟲防治的範圍，使其超出單獨使用式 1 化合物所防治的範圍。

【0292】 表 A 列出說明本發明之混合物、組成物與方法之式 1 化合物與其他無脊椎動物害蟲防治劑之特定組合。表 A 第一欄列出該特定無脊椎動物害蟲防治劑（例如：第一行中的「阿巴汀 (abamectin)」）。表 A 第二欄列出該無脊椎害蟲防治劑的作用模式（若為已知）或化學種類。表 A 第三欄列出該無脊椎害蟲防治劑相對於式 1 化合物的可施用比例之重量比範圍之實施例（例如，阿巴汀 (abamectin) 與式 1 化合物之重量比為「50:1 至 1:50」）。因此，例如表 A 第一行具體揭示式 1 化合物與阿巴汀 (abamectin) 的組合可以

介於 50 : 1 至 1 : 50 之間之重量比施用。表 A 其餘行的架構與其類似。值得進一步注意的為表 A 列出說明本發明之混合物、組成物與方法之式 1 化合物與其他無脊椎動物害蟲防治劑之特定組合，且包括其他施用比例之重量比範圍之實施例。

表 A

無脊椎動物害蟲防治劑	作用模式或化學分類	典型重量比
阿巴汀(abamectin)	氯離子通道活化劑	50:1 至 1:50
亞滅培(acetamiprid)	菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)促效劑	150:1 至 1:200
三亞蹻(amitraz)	章魚胺受體促效劑	200:1 至 1:100
阿維菌素(ivermectin)	巨環內酯類	50:1 至 1:50
印棟素(azadirachtin)	作用位點未知	100:1 至 1:120
貝塔賽扶寧 (Beta-cyfluthrin)	鈉離子通道調節劑	150:1 至 1:200
畢芬寧(bifenthrin)	鈉離子通道調節劑	100:1 至上午 01:10
布芬淨(buprofezin)	幾丁質生物合成抑制劑	500:1 至 1:50
培丹(cartap)	菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)通道阻斷劑(nAChR)	100:1 至 1:200
剋安勃 (Chlorantraniliprole)	阿諾鹼受體調節劑	100:1 至 1:120
克凡派(chlorfenapyr)	氧化磷酸化解偶聯劑	300:1 至 1:200
陶斯松(chlorpyrifos)	乙醯膽鹼酯酶抑制劑	500:1 至 1:200
可尼丁 clothianidin)	菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)促效劑	100:1 至 1:400
氰特破 (Cyantraniliprole)	阿諾鹼受體調節劑	100:1 至 1:120
賽扶寧(cyfluthrin)	鈉離子通道調節劑	150:1 至 1:200
賽洛寧(cyhalothrin)	鈉離子通道調節劑	150:1 至 1:200
賽滅寧(cypermethrin)	鈉離子通道調節劑	150:1 至 1:200
賽滅淨(cyromazine)	雙翅類昆蟲蛻皮干擾劑	400:1 至 1:50
第滅寧(deltamethrin)	鈉離子通道調節劑	50:1 至 1:400
地特靈(diieldrin)	GABA 閘控氯離子通道拮抗劑	200:1 至 1:100
達特南(dinotefuran)	菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)促效劑	150:1 至 1:200
苯蟲醚(diofenolan)	青春激素擬似物(juvenile hormone mimics)	150:1 至 1:200
因滅汀(Emamectin)	氯離子通道活化劑	50:1 至上午 01:10
安殺番(Endosulfan)	GABA 閘控氯離子通道拮抗劑	200:1 至 1:100
益化利(esfenvalerate)	鈉離子通道調節劑	100:1 至 1:400

無脊椎動物害蟲防治劑	作用模式或化學分類	典型重量比
乙蟲清(ethiprole)	GABA 調節氯離子通道拮抗劑	200:1 至 1:100
芬硫克(fenothiocarb)		150:1 至 1:200
芬諾克(Fenoxycarb)	青春激素擬似物(juvenile hormone mimics)	500:1 至 1:100
芬化利(fenvalerate)	鈉離子通道調節劑	150:1 至 1:200
芬普尼(Fipronil)	GABA 調節氯離子通道拮抗劑	150:1 至 1:100
氟尼胺 (flonicamid)	選擇性同翅昆蟲攝食阻斷劑	200:1 至 1:100
氟蟲醯胺 (Flubendiamide)	阿諾鹼受體調節劑	100:1 至 1:120
氟芬隆(flufenoxuron)	幾丁質生物合成抑制劑	200:1 至 1:100
六伏隆(hexaflumuron)	幾丁質生物合成抑制劑	300:1 至 1:50
愛美松 (hydramethylnon)	粒線體複合體 III 電子傳輸抑制劑	150:1 至 1:250
益達胺(imidacloprid)	菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)促效劑	1000:1 至 1:1000
因得克(indoxacarb)	電壓依賴型鈉離子通道阻斷劑	200:1 至 1:50
拉目達賽洛寧 (Lambda-cyhalothrin)	鈉離子通道調節劑	50:1 至 1:250
祿芬隆(lufenuron)	幾丁質生物合成抑制劑	500:1 至 1:250
美氟綜 (metaflumizone)	電壓依賴型鈉離子通道阻斷劑	200:1 至 1:200
納乃得 (methomyl)	乙醯膽鹼酯酶抑制劑	500:1 至 1:100
美賜平(methoprene)	青春激素擬似物(juvenile hormone mimics)	500:1 至 1:100
滅芬諾 (methoxyfenozide)	蛻皮激素受體促效劑	50:1 至 1:50
烯啶蟲胺(nitenpyram)	菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)促效劑	150:1 至 1:200
尼殺賽(nithiazine)	菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)促效劑	150:1 至 1:200
諾伐隆 (novaluron)	幾丁質生物合成抑制劑	500:1 至 1:150
毆殺滅 (Oxamyl)	乙醯膽鹼酯酶抑制劑	200:1 至 1:200
派滅淨(pymetrozine)	選擇性同翅昆蟲攝食阻斷劑	200:1 至 1:100
除蟲菊精 (pyrethrin)	鈉離子通道調節劑	100:1 至上午 01:10
畢達本 (pyridaben)	粒線體複合體 I 電子傳輸抑制劑	200:1 至 1:100
啞蟲丙醚(pyridalyl)	作用位點未知	200:1 至 1:100
百利普芬 (pyriproxyfen)	青春激素擬似物(juvenile hormone mimics)	500:1 至 1:100
阿諾鹼(ryanodine)	阿諾鹼受體配體	100:1 至 1:120
賜托拉(spinetoram)	菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)別構活化物	150:1 至 1:100
賜諾殺 (spinosad)	菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)別構活化物	500:1 至上午 01:10
賜派芬(spiridiclofen)	乙醯 CoA 羧化酶抑制劑	200:1 至 1:200
螺甲蟎酯 (spiromesifen)	乙醯 CoA 羧化酶抑制劑	200:1 至 1:200

無脊椎動物害蟲防治劑	作用模式或化學分類	典型重量比
得芬諾(tebufenozide)	蛻皮激素受體促效劑	500:1 至 1:250
賽果培(thiacloprid)	菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)促效劑	100:1 至 1:200
賽速安 (thiamethoxam)	菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)促效劑	1250:1 至 1:1000
硫敵克(thiodicarb)	乙醯膽鹼酯酶抑制劑	500:1 至 1:400
殺蟲單(thiosultap- sodium)	菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)通道阻 斷劑	150:1 至 1:100
泰滅寧(tralomethrin)	鈉離子通道調節劑	150:1 至 1:200
啞蚜威(triazamate)	乙醯膽鹼酯酶抑制劑	250:1 至 1:100
Triflumezopyrim		
三福隆(triflumuron)	幾丁質合成抑制劑	200:1 至 1:100
蘇力菌( <i>Bacillus thuringiensis</i> )	生物製劑	50:1 至上午 01:10
蘇力菌德他內毒素 ( <i>Bacillus thuringiensis delta-endotoxin</i> )	生物製劑	50:1 至上午 01:10
NPV (如, Gemstar)	生物製劑	50:1 至上午 01:10

【0293】 值得注意的是其中至少一種其他具有生物活性的化合物或藥劑係選自列於上表 A 之無脊椎動物害蟲防治劑之本發明之組成物。

【0294】 化合物（包括一式 1 化合物、其一 *N*-氧化物或一鹽）對其他無脊椎動物害蟲防治劑之重量比通常介於 1000:1 至 1:1000 之間，其中一實施例為介於 500:1 至 1:500 之間，另一個實施例為介於 250:1 至 1:200 之間，且另一個實施例為介於 100:1 至 1:50 之間。

【0295】 以下表 B1 至 B10 中所列示者為包含一式 1 化合物（化合物編號參照索引表 A-N 中之化合物）與一其他無脊椎動物害蟲防治劑之特定組成物的實施例。

表 B1

混合 物編 號	化 以 及 合 物 編 號 無脊椎動物害蟲防治劑	混合 物編 號	化 以 及 合 物 編 號 無脊椎動物害蟲防治劑
B1-1	8 以及 阿巴汀(abamectin)	B1-38	8 以及 因得克(indoxacarb)
B1-2	8 以及 亞滅培(acetamiprid)	B1-39	8 以及 拉目達賽洛寧 (Lambda-cyhalothrin)
B1-3	8 以及 三亞蹠(amitraz)	B1-40	8 以及 祿芬隆(lufenuron)
B1-4	8 以及 阿維菌素(avermectin)	B1-41	8 以及 美氟綜 (metaflumizone)
B1-5	8 以及 印楝素(azadirachtin)	B1-42	8 以及 納乃得(methomyl)
B1-6	8 以及 免速達(Bensultap)	B1-43	8 以及 美賜平(methoprene)
B1-7	8 以及 貝塔賽扶寧(Beta-cyfluthrin)	B1-44	8 以及 滅芬諾 (methoxyfenozide)
B1-8	8 以及 畢芬寧(bifenthrin)	B1-45	8 以及 烯啶蟲胺(nitenpyram)
B1-9	8 以及 布芬淨(buprofezin)	B1-46	8 以及 尼殺賽(nithiazine)
B1-10	8 以及 培丹(cartap)	B1-47	8 以及 諾伐隆(novaluron)
B1-11	8 以及 剋安勃 (Chlorantraniliprole)	B1-48	8 以及 毆殺滅(Oxamyl)
B1-12	8 以及 克凡派(chlorfenapyr)	B1-49	8 以及 益滅松(Phosmet)
B1-13	8 以及 陶斯松(chlorpyrifos)	B1-50	8 以及 派滅淨(pymetrozine)
B1-14	8 以及 可尼丁(clothianidin)	B1-51	8 以及 除蟲菊精(pyrethrin)
B1-15	8 以及 氰特破 (Cyantraniliprole)	B1-52	8 以及 畢達本(pyridaben)
B1-16	8 以及 賽扶寧(cyfluthrin)	B1-53	8 以及 啶蟲丙醚(pyridalyl)
B1-17	8 以及 賽洛寧(cyhalothrin)	B1-54	8 以及 百利普芬 (pyriproxyfen)
B1-18	8 以及 賽滅寧(cypermethrin)	B1-55	8 以及 阿諾鹼(ryanodine)
B1-19	8 以及 賽滅淨(cyromazine)	B1-56	8 以及 賜托拉(spinetoram)
B1-20	8 以及 第滅寧(deltamethrin)	B1-57	8 以及 賜諾殺(spinosad)
B1-21	8 以及 地特靈(dieldrin)	B1-58	8 以及 賜派芬(spiridiclofen)
B1-22	8 以及 達特南(dinotefuran)	B1-59	8 以及 螺甲蟎酯 (spiromesifen)
B1-23	8 以及 苯蟲醚(diufenolan)	B1-60	8 以及 螺蟲乙酯 (Spirotetramat)
B1-24	8 以及 因滅汀(Emamectin)	B1-61	8 以及 賜殺羅(Sulfoxaflor)
B1-25	8 以及 安殺番(Endosulfan)	B1-62	8 以及 得芬諾(tebufenozide)
B1-26	8 以及 益化利(esfenvalerate)	B1-63	8 以及 七氟菊酯(Tefluthrin)
B1-27	8 以及 乙蟲清(ethiprole)	B1-64	8 以及 賽果培(thiaclopid)
B1-28	8 以及 芬硫克(fenothiocarb)	B1-65	8 以及 賽速安 (thiamethoxam)
B1-29	8 以及 芬諾克(Fenoxycarb)	B1-66	8 以及 硫敵克(thiodicarb)
B1-30	8 以及 芬化利(fenvalerate)	B1-67	8 以及 殺蟲單(thiosultap-sodium)
B1-31	8 以及 芬普尼(Fipronil)	B1-68	8 以及 脫芬瑞(tolfenpyrad)

混合物編號	化合物編號 以及 無脊椎動物害蟲防治劑	混合物編號	化合物編號 以及 無脊椎動物害蟲防治劑
B1-32	8 以及 氟尼胺 (flonicamid)	B1-69	8 以及 泰滅寧(tralomethrin)
B1-33	8 以及 氟蟲醯胺 (Flubendiamide)	B1-70	8 以及 啞蚜威(triazamate)
B1-34	8 以及 氟芬隆(flufenoxuron)	B1-71	8 以及 Triflumezopyrim
B1-35	8 以及 六伏隆(hexaflumuron)	B1-72	8 以及 三福隆(triflumuron)
B1-36	8 以及 愛美松 (hydramethylnon)	B1-73	8 以及 蘇力菌( <i>Bacillus thuringiensis</i> )
B1-37	8 以及 益達胺(imidacloprid)	B1-74	8 以及 (蘇力菌德他內毒素 <i>Bacillus thuringiensis</i> delta-endotoxin)
		B1-75	8 以及 NPV (如, Gemstar)

表 B2

【0296】 表 B2 與表 B1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 14。例如，表 B2 中第一個混合物標示為 B2-1，且為化合物 14 與其他無脊椎動物害蟲防治劑阿巴汀 (abamectin) 之混合物。

表 B3

【0297】 表 B3 與表 B1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 16。例如，表 B3 中第一個混合物標示為 B3-1，且為化合物 16 與其他無脊椎動物害蟲防治劑阿巴汀 (abamectin) 之混合物。

表 B4



**【0298】** 表 B4 與表 B1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 19。例如，表 B4 中第一個混合物標示為 B4-1，且為化合物 19 與其他無脊椎動物害蟲防治劑阿巴汀（abamectin）之混合物。

#### 表 B5

**【0299】** 表 B5 與表 B1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 41。例如，表 B5 中第一個混合物標示為 B5-1，且為化合物 41 與其他無脊椎動物害蟲防治劑阿巴汀（abamectin）之混合物。

#### 表 B6

**【0300】** 表 B6 與表 B1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 42。例如，表 B6 中第一個混合物標示為 B6-1，且為化合物 42 與其他無脊椎動物害蟲防治劑阿巴汀（abamectin）之混合物。

#### 表 B7

**【0301】** 表 B7 與表 B1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 51。例如，表 B7 中第一個混合物標示為 B7-1，且為化合物 51 與其他無脊椎動物害蟲防治劑阿巴汀（abamectin）之混合物。

## 表 B8

【0302】 表 B8 與表 B1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 54。例如，表 B8 中第一個混合物標示為 B8-1，且為化合物 54 與其他無脊椎動物害蟲防治劑阿巴汀（abamectin）之混合物。

## 表 B9

【0303】 表 B9 與表 B1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 55。例如，表 B9 中第一個混合物標示為 B9-1，且為化合物 55 與其他無脊椎動物害蟲防治劑阿巴汀（abamectin）之混合物。

## 表 B10

【0304】 表 B10 與表 B1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 76。例如，表 B10 中第一個混合物標示為 B10-1，且為化合物 76 與其他無脊椎動物害蟲防治劑阿巴汀（abamectin）之混合物。

【0305】 列示於表 B1 至 B10 內之特定混合物典型會以表 A 中所指定之比例組合式 1 化合物與其他無脊椎動物害蟲防治劑。

【0306】 以下表 C1 至 C10 中所列示者為包含一式 1 化合物（化合物編號參照索引表 A-N 中之化合物）與一其他無脊椎動物害蟲防治

劑之特定混合物。表 C1 至 C10 進一步列出表 C1 至 C10 之混合物的典型特定重量比。例如，表 C1 第一行的第一個重量比欄位具體揭露了索引表 A 之化合物 8 與阿巴汀以 100 份的化合物 1 比上 1 份的阿巴汀之重量比施用的混合物。

表 C1

混合物編號	化合物以及無脊椎動物害蟲防治劑 編號	典型混合物比例 (以重量計)									
		100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-1	8 以及 阿巴汀(abamectin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-2	8 以及 亞滅培(acetamiprid)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-3	8 以及 三亞蹠(amitraz)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-4	8 以及 阿維菌素 (avermectin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-5	8 以及 印棟素(azadirachtin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-6	8 以及 免速達(Bensultap)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-7	8 以及 貝塔賽扶寧 (Beta-cyfluthrin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-8	8 以及 畢芬寧(bifenthrin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-9	8 以及 布芬淨(buprofezin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-10	8 以及 培丹(cartap)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-11	8 以及 剋安勃 (Chlorantraniliprole)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-12	8 以及 克凡派 (chlorfenapyr)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-13	8 以及 陶斯松(chlorpyrifos)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-14	8 以及 可尼丁(clothianidin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-15	8 以及 氰特破 (Cyantraniliprole)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-16	8 以及 賽扶寧(cyfluthrin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-17	8 以及 賽洛寧(cyhalothrin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-18	8 以及 賽滅寧 (cypermethrin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-19	8 以及 賽滅淨(cyromazine)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-20	8 以及 第滅寧 (deltamethrin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-21	8 以及 地特靈(diieldrin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	
C1-22	8 以及 達特南(dinotefuran)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100	

C1-23	8	以及 苯蟲醯(diofenolan)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-24	8	以及 因滅汀(Emamectin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-25	8	以及 安殺番(Endosulfan)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-26	8	以及 益化利 (esfenvalerate)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-27	8	以及 乙蟲清(ethiprole)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-28	8	以及 芬硫克 (fenothiocarb)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-29	8	以及 芬諾克(Fenoxycarb)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-30	8	以及 芬化利(fenvalerate)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-31	8	以及 芬普尼(Fipronil)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-32	8	以及 氟尼胺 (flonicamid)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-33	8	以及 氟蟲醯胺 (Flubendiamide)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-34	8	以及 氟芬隆 (flufenoxuron)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-35	8	以及 六伏隆 (hexaflumuron)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-36	8	以及 愛美松 (hydramethylnon)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-37	8	以及 益達胺 (imidacloprid)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-38	8	以及 因得克(indoxacarb)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-39	8	以及 拉目達賽洛寧 (Lambda-cyhalothrin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-40	8	以及 祿芬隆(lufenuron)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-41	8	以及 美氟綜 (metaflumizone)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-42	8	以及 納乃得 (methomyl)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-43	8	以及 美賜平(methoprene)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-44	8	以及 滅芬諾 (methoxyfenozide)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-45	8	以及 烯啞蟲胺 (nitenpyram)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-46	8	以及 尼殺賽(nithiazine)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-47	8	以及 諾伐隆 (novaluron)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-48	8	以及 毆殺滅(Oxamyl)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-49	8	以及 益滅松(Phosmet)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-50	8	以及 派滅淨(pymetrozine)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-51	8	以及 除蟲菊精 (pyrethrin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

C1-52	8 以及	畢達本 (pyridaben)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-53	8 以及	吡蟲丙醚(pyridalyl)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-54	8 以及	百利普芬 (pyriproxyfen)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-55	8 以及	阿諾鹼(ryanodine)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-56	8 以及	賜托拉(spinetoram)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-57	8 以及	賜諾殺 (spinosad)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-58	8 以及	賜派芬 (spiridiclofen)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-59	8 以及	螺甲蟎酯 (spiromesifen)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-60	8 以及	螺蟲乙酯 (Spirotetramat)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-61	8 以及	賜殺羅(Sulfoxaflor)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-62	8 以及	得芬諾 (tebufenozide)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-63	8 以及	七氟菊酯(Tefluthrin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-64	8 以及	賽果培(thiacloprid)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-65	8 以及	賽速安 (thiamethoxam)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-66	8 以及	硫敵克(thiodicarb)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-67	8 以及	殺蟲單(thiosultap- sodium)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-68	8 以及	脫芬瑞 (tolfenpyrad)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-69	8 以及	泰滅寧(tralomethrin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-70	8 以及	啞蚜威(triazamate)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-71	8 以及	Triflumezopyrim	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-72	8 以及	三福隆(triflumuron)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-73	8 以及	蘇力菌( <i>Bacillus thuringiensis</i> )	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-74	8 以及	蘇力菌德他內毒素 ( <i>Bacillus thuringiensis</i> delta- endotoxin)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-75	8 以及	NPV (如, Gemstar)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

表 C2

【0307】 表 C2 與表 C1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 14。例如，表 C2 第一行的第

一個重量比欄位具體揭露了化合物 14 與阿巴汀以 100 份的化合物 1 比上 1 份的阿巴汀之重量比施用的混合物。

### 表 C3

**【0308】** 表 C3 與表 C1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 16。例如，表 C3 第一行的第一個重量比欄位具體揭露了化合物 16 與阿巴汀以 100 份的化合物 1 比上 1 份的阿巴汀之重量比施用的混合物。

### 表 C4

**【0309】** 表 C4 與表 C1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 19。例如，表 C4 第一行的第一個重量比欄位具體揭露了化合物 19 與阿巴汀以 100 份的化合物 1 比上 1 份的阿巴汀之重量比施用的混合物。

### 表 C5

**【0310】** 表 C5 與表 C1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 41。例如，表 C5 第一行的第一個重量比欄位具體揭露了化合物 41 與阿巴汀以 100 份的化合物 1 比上 1 份的阿巴汀之重量比施用的混合物。

### 表 C6

**【0311】** 表 C6 與表 C1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 42。例如，表 C6 第一行的第一個重量比欄位具體揭露了化合物 42 與阿巴汀以 100 份的化合物 1 比上 1 份的阿巴汀之重量比施用的混合物。

#### 表 C7

**【0312】** 表 C7 與表 C1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 51。例如，表 C7 第一行的第一個重量比欄位具體揭露了化合物 51 與阿巴汀以 100 份的化合物 1 比上 1 份的阿巴汀之重量比施用的混合物。

#### 表 C8

**【0313】** 表 C8 與表 C1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 54。例如，表 C8 第一行的第一個重量比欄位具體揭露了化合物 54 與阿巴汀以 100 份的化合物 1 比上 1 份的阿巴汀之重量比施用的混合物。

#### 表 C9

**【0314】** 表 C9 與表 C1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 55。例如，表 C9 第一行的第一個重量比欄位具體揭露了化合物 55 與阿巴汀以 100 份的化合物 1 比上 1 份的阿巴汀之重量比施用的混合物。

表 C10

【0315】 表 C10 與表 C1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 76。例如，表 C10 第一行的第一個重量比欄位具體揭露了化合物 76 與阿巴汀以 100 份的化合物 1 比上 1 份的阿巴汀之重量比施用的混合物。

【0316】 以下表 D1 至 D10 中所列示者為包含一式 1 化合物（化合物編號參照索引表 A-N 中之化合物）與一其他殺真菌劑之特定組成物的實施例。

表 D1

混合物編號	化 以 及 合 物 編 號	殺真菌劑	混合物編號	化 以 及 合 物 編 號	殺真菌劑
D1-1	8 以及	撲殺熱(Probenazole)	D1-17	8 以及	待克利(Difenoconazole)
D1-2	8 以及	噻噁菌胺(Tiadinil)	D1-18	8 以及	環克座(Cyproconazole)
D1-3	8 以及	異噻菌胺(Isotianil)	D1-19	8 以及	普克利(Propiconazole)
D1-4	8 以及	百快隆(Pyroquilon)	D1-20	8 以及	氰菌胺(Fenoxanil)
D1-5	8 以及	苯氧菌胺 (Metominostrobin)	D1-21	8 以及	富米綜(Ferimzone)
D1-6	8 以及	福多寧(Flutolanil)	D1-22	8 以及	熱必斯(Fthalide)
D1-7	8 以及	維利黴素(Validamycin)	D1-23	8 以及	嘉賜黴素(Kasugamycin)
D1-8	8 以及	福拉比(Furametpyr)	D1-24	8 以及	啞氧菌酯(Picoxystrobin)
D1-9	8 以及	賓克隆(Pencycuron)	D1-25	8 以及	吡噻菌胺(Penthiopyrad)
D1-10	8 以及	矽氟唑(Simeconazole)	D1-26	8 以及	凡殺同(Famoxadone)
D1-11	8 以及	肱醚菌胺(Orysastrobin)	D1-27	8 以及	克絕(Cymoxanil)
D1-12	8 以及	三氟敏(Trifloxystrobin)	D1-28	8 以及	丙氧喹啉(Proquinazid)
D1-13	8 以及	亞賜圍(Isoprothiolane)	D1-29	8 以及	護矽得(Flusilazole)
D1-14	8 以及	亞托敏(Azoxystrobin)	D1-30	8 以及	鋅錳乃浦(Mancozeb)
D1-15	8 以及	三賽唑(Tricyclazole)	D1-31	8 以及	氫氧化銅
D1-16	8 以及	菲克利(Hexaconazole)	D1-32	8 以及	(a)



(a) 1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-1-基]乙酮

### 表 D2

【0317】 表 D2 與表 D1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 14。例如，表 D2 中第一個混合物標示為 D2-1，且為化合物 14 與其他殺真菌劑撲殺熱（probenazole）之混合物。

### 表 D3

【0318】 表 D3 與表 D1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 16。例如，表 D3 中第一個混合物標示為 D3-1，且為化合物 16 與其他殺真菌劑撲殺熱（probenazole）之混合物。

### 表 D4

【0319】 表 D4 與表 D1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 19。例如，表 D4 中第一個混合物標示為 D4-1，且為化合物 19 與其他殺真菌劑撲殺熱（probenazole）之混合物。

### 表 D5

**【0320】** 表 D5 與表 D1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 41。例如，表 D5 中第一個混合物標示為 D5-1，且為化合物 41 與其他殺真菌劑撲殺熱 (probenazole) 之混合物。

#### 表 D6

**【0321】** 表 D6 與表 D1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 42。例如，表 D6 中第一個混合物標示為 D6-1，且為化合物 42 與其他殺真菌劑撲殺熱 (probenazole) 之混合物。

#### 表 D7

**【0322】** 表 D7 與表 D1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 51。例如，表 D7 中第一個混合物標示為 D7-1，且為化合物 51 與其他殺真菌劑撲殺熱 (probenazole) 之混合物。

#### 表 D8

**【0323】** 表 D8 與表 D1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 54。例如，表 D8 中第一個混合物標示為 D8-1，且為化合物 54 與其他殺真菌劑撲殺熱 (probenazole) 之混合物。

## 表 D9

【0324】 表 D9 與表 D1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 55。例如，表 D9 中第一個混合物標示為 D9-1，且為化合物 55 與其他殺真菌劑撲殺熱（probenazole）之混合物。

## 表 D10

【0325】 表 D10 與表 D1 完全相同，除了在標題「化合物編號」之欄中的每個化合物 8 皆置換成化合物 76。例如，表 D10 第一個混合物標示為 D10-1，且為化合物 76 與其他殺真菌劑撲殺熱（probenazole）之混合物。

【0326】 在農藝及非農藝應用中，無脊椎動物害蟲之防治係藉由施用生物有效量之一或多種本發明化合物（通常呈組成物形式）至害蟲環境（包括農藝及/或非農藝之受侵染地區）、至有待保護之區域或直接施用至有待防治之害蟲來進行。

【0327】 因此，本發明包含一種用於在農藝及/或非農藝應用中防治無脊椎動物害蟲之方法，其包含使該無脊椎動物害蟲或其環境與生物有效量之一或多種本發明化合物接觸，或與包含至少一種該化合物之組成物，或包含至少一種該化合物及生物有效量之至少一種其他生物活性化合物或藥劑的組成物接觸。包含本發明化合物及生物有效量之至少一種其他生物活性化合物或藥劑的合適組成物之實例包括粒

劑組成物，其中該其他活性化合物係存在於與本發明化合物相同之粒劑上，或存在於與本發明化合物不同之粒劑上。

**【0328】** 為達成與本發明之化合物或組成物接觸以保護農作物免遭無脊椎動物害蟲侵害，該化合物或組成物通常施用於種植之前的作物種子、作物植物之葉（例如，葉、莖、花、果實）或作物種植之前或之後的土壤或其他生長介質。

**【0329】** 接觸方法之一實施例係透過噴灑。或者，一包含本發明化合物之粒劑組成物可被施用於植物之葉或土壤。本發明之化合物亦可經由植物吸收被有效地遞送，該吸收係藉由使該植物與經施用為液體配方之土壤澆灌液、施用至土壤之粒劑配方、苗箱處理或移栽植物浸泡液之包含本發明之化合物的組成物接觸。值得注意的是呈土壤澆灌液液體配方形式之本發明之組成物。亦值得注意的是用於防治無脊椎動物害蟲之方法，其包含使無脊椎動物害蟲或其環境與生物有效量之本發明化合物接觸，或與包含生物有效量之本發明之化合物的組成物接觸。進一步值得注意的是其中之環境為土壤且該組成物係經施用至該土壤作為土壤澆灌液配方之此方法。進一步值得注意的是本發明之化合物亦可有效地用於局部施用至感染位置。其他接觸方法包括藉由直接及殘餘噴灑、空中噴灑、凝膠、種子塗佈、微囊封、系統吸收、誘餌、耳標、食團、噴霧器(fogger)、燻蒸劑、霧劑(aerosol)、塵粉與許多其他方式施用本發明之化合物或組成物。接觸方法之一實施例為包含本發明之化合物或組成物之尺寸穩定的肥料粒劑、棒或片

劑。本發明之化合物亦可注入用於製造無脊椎動物防治裝置（例如，防蟲網）之材料中。

**【0330】** 本發明之化合物可用於處理所有植物、植物部位與種子。植物及種子變種及栽培品種可藉由習知的繁殖及培育方法得到，或藉由基因工程方法得到。經基因改造之植物或種子（基因轉殖植物或種子）為其中異源基因（轉殖基因）已被穩定結合至植物或種子的基因體中之植物或種子。由在植物基因體中的特定位置所定義之轉殖基因被稱為轉形（transformation）或基因轉殖（transgenic）事件。

**【0331】** 可根據本發明處理的基因改造植物及種子栽培品種包括該些可抵抗一或多種生物壓力（害蟲，例如：線蟲、昆蟲、蟎類、真菌等）或非生物壓力（乾旱、低溫、土壤鹽度等）者，或含有其他所欲之特性者。植物及種子可經基因改造而展現例如除草劑耐受性、昆蟲抗性、經改良的油脂特性或乾旱耐受性性狀。含有單一基因轉形事件或轉形事件組合的有用基因改造植物及種子係列於表 Z。有關表 Z 中之基因改造的額外資訊可得自下列資料庫：

<http://www2.oecd.org/biotech/byidentifier.aspx>

<http://www.aphis.usda.gov>

<http://gmoinfo.jrc.ec.europa.eu>

**【0332】** 表 Z 中所用之下列縮寫如下：tol. 為耐受性，res. 為抗性，SU 為磺醯脲，ALS 為乙醯乳酸合成酶，HPPD 為 4-羥基苯基丙酮酸二氧酶，NA 為無法取得？

表 Z

作物	事件名	事件碼	性狀	基因
苜蓿草	J101	MON-00101-8	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)
苜蓿草	J163	MON-ØØ163-7	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)
菜籽*	23-18-17 (事件 18)	CGN-89465-2	高月桂酸油	te
菜籽*	23-198 (事件 23)	CGN-89465-2	高月桂酸油	te
菜籽*	61061	DP-Ø61Ø61-7	草甘膦 (Glyphosate) tol.	gat4621
菜籽*	73496	DP-Ø73496-4	草甘膦 (Glyphosate) tol.	gat4621
菜籽*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
菜籽*	GT73 (RT73)	MON-ØØØ73-7	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
菜籽*	HCN10 (Topas 19/2)	NA	草銨膦 (Glufosinate) tol.	bar
菜籽*	HCN28 (T45)	ACS-BNØØ8-2	草銨膦 (Glufosinate) tol.	pat (syn)
菜籽*	HCN92 (Topas 19/2)	ACS-BNØØ7-1	草銨膦 (Glufosinate) tol.	bar
菜籽*	MON88302	MON-883Ø2-9	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)
菜籽*	MPS961	NA	植酸鹽分解	phyA
菜籽*	MPS962	NA	植酸鹽分解	phyA
菜籽*	MPS963	NA	植酸鹽分解	phyA
菜籽*	MPS964	NA	植酸鹽分解	phyA
菜籽*	MPS965	NA	植酸鹽分解	phyA
菜籽*	MS1 (B91-4)	ACS-BNØØ4-7	草銨膦 (Glufosinate) tol.	bar
菜籽*	MS8	ACS-BNØØ5-8	草銨膦 (Glufosinate) tol.	bar
菜籽*	OXY-235	ACS-BNØ11-5	苯腈(Oxynil) tol.	bxn
菜籽*	PHY14	NA	草銨膦 (Glufosinate) tol.	bar
菜籽*	PHY23	NA	草銨膦 (Glufosinate) tol.	bar
菜籽*	PHY35	NA	草銨膦 (Glufosinate) tol.	bar
菜籽*	PHY36	NA	草銨膦 (Glufosinate) tol.	bar
菜籽*	RF1 (B93-101)	ACS-BNØØ1-	草銨膦	bar

菜籽*	RF2 (B94-2)	4 ACS-BN002-5	(Glufosinate) tol. 草銨磷 (Glufosinate) tol.	bar
菜籽*	RF3	ACS-BN003-6	草銨磷 (Glufosinate) tol.	bar
豆	EMBRAPA 5.1	EMB-PV051-1	疾病 res.	ac1 (正義及反義)
茄 (茄子)	EE-1		昆蟲 res.	cry1Ac
康乃馨	11 (7442)	FLO-07442-4	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
康乃馨	11363 (1363A)	FLO-11363-1	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
康乃馨	1226A (11226)	FLO-11226-8	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
康乃馨	123.2.2 (40619)	FLO-40619-7	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
康乃馨	123.2.38 (40644)	FLO-40644-4	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
康乃馨	123.8.12	FLO-40689-6	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
康乃馨	123.8.8 (40685)	FLO-40685-1	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
康乃馨	1351A (11351)	FLO-11351-7	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
康乃馨	1400A (11400)	FLO-11400-2	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
康乃馨	15	FLO-00015-2	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
康乃馨	16	FLO-00016-3	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
康乃馨	4	FLO-00004-9	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
康乃馨	66	FLO-00066-8	SU tol. ; 延遲老化	surB; acc
康乃馨	959A (11959)	FLO-11959-3	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
康乃馨	988A (11988)	FLO-11988-7	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
康乃馨	26407	IFD-26497-2	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
康乃馨	25958	IFD-25958-3	SU tol. ; 經改良花色	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
菊苣	RM3-3	NA	草銨磷 (Glufosinate) tol.	bar
菊苣	RM3-4	NA	草銨磷 (Glufosinate) tol.	bar

菊苣	RM3-6	NA	草銨磷 (Glufosinate) tol.	bar
棉花	19-51a	DD-Ø1951A-7	ALS 除草劑 tol.	S4-HrA
棉花	281-24-236	DAS-24236-5	草銨磷 (Glufosinate) tol.; 昆蟲 res.	pat (syn); cry1F
棉花	3006-210-23	DAS-21Ø23-5	草銨磷 (Glufosinate) tol.; 昆蟲 res.	pat (syn); cry1Ac
棉花	31707	NA	苯腈(Oxynil) tol.; 昆蟲 res.	bxn; cry1Ac
棉花	31803	NA	苯腈(Oxynil) tol.; 昆蟲 res.	bxn; cry1Ac
棉花	31807	NA	苯腈(Oxynil) tol.; 昆蟲 res.	bxn; cry1Ac
棉花	31808	NA	苯腈(Oxynil) tol.; 昆蟲 res.	bxn; cry1Ac
棉花	42317	NA	苯腈(Oxynil) tol.; 昆蟲 res.	bxn; cry1Ac
棉花	BNLA-601	NA	昆蟲 res.	cry1Ac
棉花	BXN10211	BXN10211-9	苯腈(Oxynil) tol.	bxn; cry1Ac
棉花	BXN10215	BXN10215-4	苯腈(Oxynil) tol.	bxn; cry1Ac
棉花	BXN10222	BXN10222-2	苯腈(Oxynil) tol.	bxn; cry1Ac
棉花	BXN10224	BXN10224-4	苯腈(Oxynil) tol.	bxn; cry1Ac
棉花	COT102	SYN-IR102-7	昆蟲 res.	vip3A(a)
棉花	COT67B	SYN-IR67B-1	昆蟲 res.	cry1Ab
棉花	COT202		昆蟲 res.	vip3A
棉花	事件 1	NA	昆蟲 res.	cry1Ac
棉花	GMF Cry1A	GTL-GMF311-7	昆蟲 res.	cry1Ab-Ac
棉花	GHB119	BCS-GH005-8	昆蟲 res.	cry2Ae
棉花	GHB614	BCS-GH002-5	草甘膦 (Glyphosate) tol.	2mepsps
棉花	GK12	NA	昆蟲 res.	cry1Ab-Ac
棉花	LLCotton25	ACS-GH001-3	草銨磷 (Glufosinate) tol.	bar
棉花	MLS 9124	NA	昆蟲 res.	cry1C
棉花	MON1076	MON-89924-2	昆蟲 res.	cry1Ac
棉花	MON1445	MON-01445-2	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)
棉花	MON15985	MON-15985-7	昆蟲 res.	cry1Ac; cry2Ab2
棉花	MON1698	MON-89383-1	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)
棉花	MON531	MON-00531-6	昆蟲 res.	cry1Ac
棉花	MON757	MON-00757-7	昆蟲 res.	cry1Ac



棉花	MON88913	MON-88913-8	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)
棉花	Nqwe Chi 6 Bt	NA	昆蟲 res.	NA?
棉花	SKG321	NA	昆蟲 res.	cry1A; CpTI
棉花	T303-3	BCS-GH003-6	昆蟲 res. ; 草銨膦 (glufosinate) tol.	cry1Ab; bar
棉花	T304-40	BCS-GH004-7	昆蟲 res. ; 草銨膦 (glufosinate) tol.	cry1Ab; bar
棉花	CE43-67B		昆蟲 res.	cry1Ab
棉花	CE46-02A		昆蟲 res.	cry1Ab
棉花	CE44-69D		昆蟲 res.	cry1Ab
棉花	1143-14A		昆蟲 res.	cry1Ab
棉花	1143-51B		昆蟲 res.	cry1Ab
棉花	T342-142		昆蟲 res.	cry1Ab
棉花	PV-GHGT07 (1445)		草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)
棉花	EE-GH3		草甘膦 (Glyphosate) tol.	mepsps
棉花	EE-GH5		昆蟲 res.	cry1Ab
棉花	MON88701	MON-88701-3	麥草畏(Dicamba) 及草銨膦 (glufosinate) tol.	經修飾之 dmo ; bar
棉花	OsCr11		抗過敏性	經修飾之 Cry j
匍匐性小 籐草	ASR368	SMG-36800-2	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)
桉樹	20-C		鹽分 tol.	codA
桉樹	12-5C		鹽分 tol.	codA
桉樹	12-5B		鹽分 tol.	codA
桉樹	107-1		鹽分 tol.	codA
桉樹	1/9/2001		鹽分 tol.	codA
桉樹	2/1/2001		鹽分 tol.	codA
亞麻	FP967	CDC-FL001-2	ALS 除草劑 tol.	als
扁豆 (Lentil)	RH44		咪唑啉酮 tol.	als
玉米	3272	SYN-E3272-5	經改良 $\alpha$ 澱粉酶	amy797E
玉米	5307	SYN-05307-1	昆蟲 res.	ecry3.1Ab
玉米	59122	DAS-59122-7	昆蟲 res. ; 草銨膦 (glufosinate) tol.	cry34Ab1; cry35Ab1; pat
玉米	676	PH-000676-7	草銨膦 (Glufosinate) tol. ; 授粉控制	pat; dam
玉米	678	PH-000678-9	草銨膦 (Glufosinate) tol. ; 授粉控制	pat; dam
玉米	680	PH-000680-2	草銨膦	pat; dam

玉米	98140	DP-098140-6	(Glufosinate) tol. ; 授粉控制 草甘膦	gat4621; zm-hra
玉米	Bt10	NA	(Glyphosate) tol. ; ALS 除草劑 tol. 昆蟲 res. ; 草銨膦	cry1Ab; pat
玉米	Bt176 (176)	SYN-EV176-9	(glufosinate) tol. 昆蟲 res. ; 草銨膦	cry1Ab; bar
玉米	BVLA430101	NA	(glufosinate) tol. 植酸鹽分解	phyA2
玉米	CBH-351	ACS-ZM004-3	昆蟲 res. ; 草銨膦	cry9C; bar
玉米	DAS40278-9	DAS40278-9	(glufosinate) tol. 2,4-D tol.	aad-1
玉米	DBT418	DKB-89614-9	昆蟲 res. ; 草銨膦	cry1Ac; pinII;
玉米	DLL25 (B16)	DKB-89790-5	(glufosinate) tol. 草銨膦	bar
玉米	GA21	MON-00021-9	(Glufosinate) tol. 草甘膦	bar
玉米	GG25		(Glyphosate) tol. 草甘膦	mepsps
玉米	GJ11		(Glyphosate) tol. 草甘膦	mepsps
玉米	F1117		(Glyphosate) tol. 草甘膦	mepsps
玉米	GAT-ZM1		(Glyphosate) tol. 草銨膦	pat
玉米	LY038	REN-00038-3	(Glufosinate) tol. 離胺酸升高	cordapA
玉米	MIR162	SYN-IR162-4	昆蟲 res.	vip3Aa20
玉米	MIR604	SYN-IR604-5	昆蟲 res.	mcry3A
玉米	MON801 (MON80100)	MON801	昆蟲 res. ; 草甘膦	cry1Ab; cp4
			(glyphosate) tol.	epsps (aroA:CP4); goxv247
玉米	MON802	MON-80200-7	昆蟲 res. ; 草甘膦	cry1Ab; cp4
			(glyphosate) tol.	epsps (aroA:CP4); goxv247
玉米	MON809	PH-MON-809- 2	昆蟲 res. ; 草甘膦	cry1Ab; cp4
			(glyphosate) tol.	epsps (aroA:CP4); goxv247
玉米	MON810	MON-00810-6	昆蟲 res. ; 草甘膦	cry1Ab; cp4
			(glyphosate) tol.	epsps (aroA:CP4); goxv247
玉米	MON832	NA	草甘膦	cp4 epsps
			(Glyphosate) tol.	(aroA:CP4); goxv247

玉米	MON863	MON-00863-5	昆蟲 res.	cry3Bb1
玉米	MON87427	MON-87427-7	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)
玉米	MON87460	MON-87460-4	乾旱 tol.	cspB
玉米	MON88017	MON-88017-3	昆蟲 res. ; 草甘膦 (glyphosate) tol.	cry3Bb1; cp4 epsps (aroA:CP4)
玉米	MON89034	MON-89034-3	昆蟲 res.	cry2Ab2; cry1A.105
玉米	MS3	ACS-ZM001-9	草銨膦 (Glufosinate) tol. ; 授粉控制	bar ; 細菌核糖 核酸酶(barnase)
玉米	MS6	ACS-ZM005-4	草銨膦 (Glufosinate) tol. ; 授粉控制	bar ; 細菌核糖 核酸酶(barnase)
玉米	NK603	MON-00603-6	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)
玉米	T14	ACS-ZM002-1	草銨膦 (Glufosinate) tol.	pat (syn)
玉米	T25	ACS-ZM003-2	草銨膦 (Glufosinate) tol.	pat (syn)
玉米	TC1507	DAS-01507-1	昆蟲 res. ; 草銨膦 (glufosinate) tol.	cry1Fa2; pat
玉米	TC6275	DAS-06275-8	昆蟲 res. ; 草銨膦 (glufosinate) tol.	mocry1F; bar
玉米	VIP1034		昆蟲 res. ; 草銨膦 (glufosinate) tol.	vip3A; pat
玉米	43A47	DP-043A47-3	昆蟲 res. ; 草銨膦 (glufosinate) tol.	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
玉米	40416	DP-040416-8	昆蟲 res. ; 草銨膦 (glufosinate) tol.	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
玉米	32316	DP-032316-8	昆蟲 res. ; 草銨膦 (glufosinate) tol.	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
玉米	4114	DP-004114-3	昆蟲 res. ; 草銨膦 (glufosinate) tol.	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
甜瓜	甜瓜 A	NA	延緩熟成/老化	sam-k
甜瓜	甜瓜 B	NA	延緩熟成/老化	sam-k
木瓜	55-1	CUH-CP551-8	疾病 res.	prsv cp
木瓜	63-1	CUH-CP631-7	疾病 res.	prsv cp
木瓜	華農(Huanong) 一號	NA	疾病 res.	prsv rep
木瓜	X17-2	UFL-X17CP-6	疾病 res.	prsv cp
牽牛花	牽牛花-CHS	NA	經改良產物品質	CHS 抑制
李子	C-5	ARS-PLMC5- 6	疾病 res.	ppv cp

菜籽**	ZSR500	NA	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
菜籽**	ZSR502	NA	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
菜籽**	ZSR503	NA	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
白楊木	Bt 白楊木	NA	昆蟲 res.	cry1Ac; API
白楊木	雜交白楊 木株 741	NA	昆蟲 res.	cry1Ac; API
白楊木	trg300-1		高纖維素	AaXEG2
白楊木	trg300-2		高纖維素	AaXEG2
馬鈴薯	1210 amk	NA	昆蟲 res.	cry3A
馬鈴薯	2904/1 kgs	NA	昆蟲 res.	cry3A
菜籽**	ZSR500	NA	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
菜籽**	ZSR502	NA	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
馬鈴薯	ATBT04-27	NMK-89367-8	昆蟲 res.	cry3A
馬鈴薯	ATBT04-30	NMK-89613-2	昆蟲 res.	cry3A
馬鈴薯	ATBT04-31	NMK-89170-9	昆蟲 res.	cry3A
馬鈴薯	ATBT04-36	NMK-89279-1	昆蟲 res.	cry3A
馬鈴薯	ATBT04-6	NMK-89761-6	昆蟲 res.	cry3A
馬鈴薯	BT06	NMK-89812-3	昆蟲 res.	cry3A
馬鈴薯	BT10	NMK-89175-5	昆蟲 res.	cry3A
馬鈴薯	BT12	NMK-89601-8	昆蟲 res.	cry3A
馬鈴薯	BT16	NMK-89167-6	昆蟲 res.	cry3A
馬鈴薯	BT17	NMK-89593-9	昆蟲 res.	cry3A
馬鈴薯	BT18	NMK-89906-7	昆蟲 res.	cry3A
馬鈴薯	BT23	NMK-89675-1	昆蟲 res.	cry3A
馬鈴薯	EH92-527-1	BPS-25271-9	經改良澱粉/碳水 化合物	gbss (反義)
馬鈴薯	HLMT15-15	NA	昆蟲及疾病 res.	cry3A; pvy cp
馬鈴薯	HLMT15-3	NA	昆蟲及疾病 res.	cry3A; pvy cp
馬鈴薯	HLMT15-46	NA	昆蟲及疾病 res.	cry3A; pvy cp
馬鈴薯	RBMT15-101	NMK-89653-6	昆蟲及疾病 res.	cry3A; pvy cp
馬鈴薯	RBMT21-129	NMK-89684-1	昆蟲及疾病 res.	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
馬鈴薯	RBMT21-152	NA	昆蟲及疾病 res.	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
馬鈴薯	RBMT21-350	NMK-89185-6	昆蟲及疾病 res.	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
馬鈴薯	RBMT22-082	NMK-89896-6	昆蟲及疾病 res. ;	cry3A; plrv orf1; plrv orf2;

馬鈴薯	RBMT22-186	NA	草甘膦 (Glyphosate) tol. 昆蟲及疾病 res. ; 草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4) cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
馬鈴薯	RBMT22-238	NA	昆蟲及疾病 res. ; 草甘膦 (Glyphosate) tol.	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
馬鈴薯	RBMT22-262	NA	昆蟲及疾病 res. ; 草甘膦 (Glyphosate) tol.	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
馬鈴薯	SEMT15-02	NMK-89935-9	昆蟲及疾病 res.	cry3A; pvy cp
馬鈴薯	SEMT15-07	NA	昆蟲及疾病 res.	cry3A; pvy cp
馬鈴薯	SEMT15-15	NMK-89930-4	昆蟲及疾病 res.	cry3A; pvy cp
馬鈴薯	SPBT02-5	NMK-89576-1	昆蟲 res.	cry3A
馬鈴薯	SPBT02-7	NMK-89724-5	昆蟲 res.	cry3A
稻米	7Crp#242-95-7		抗過敏性	7crp
稻米	7Crp#10	NA	抗過敏性	7crp
稻米	GM Shanyou 63	NA	昆蟲 res.	cry1Ab; cry1Ac
稻米	Huahui-1/ TT51-1	NA	昆蟲 res.	cry1Ab; cry1Ac
稻米	LLRICE06	ACS-OS001-4	草銨膦 (Glufosinate) tol.	bar
稻米	LLRICE601	BCS-OS003-7	草銨膦 (Glufosinate) tol.	bar
稻米	LLRICE62	ACS-OS002-5	草銨膦 (Glufosinate) tol.	bar
稻米	Tarom molaii + cry1Ab	NA	昆蟲 res.	cry1Ab (截 短)
稻米	GAT-OS2		草銨膦 (Glufosinate) tol.	bar
稻米	GAT-OS3		草銨膦 (Glufosinate) tol.	bar
稻米	PE-7		昆蟲 res.	Cry1Ac
稻米	7Crp#10	NA	抗過敏性	7crp
稻米	KPD627-8		高色胺酸	OASA1D
稻米	KPD722-4		高色胺酸	OASA1D
稻米	KA317		高色胺酸	OASA1D
稻米	HW5		高色胺酸	OASA1D
稻米	HW1		高色胺酸	OASA1D
稻米	B-4-1-18		直立葉半矮性	Δ OsBRI1
稻米	G-3-3-22		半矮性	OSGA2ox1
稻米	AD77		疾病 res.	DEF
稻米	AD51		疾病 res.	DEF

稻米	AD48		疾病 res.	DEF
稻米	AD41		疾病 res.	DEF
稻米	13pNasNaatAprt1		低鐵 tol.	HvNAS1; HvNAAT-A; APRT
稻米	13pAprt1		低鐵 tol.	APRT
稻米	gHvNAS1- gHvNAAT-1		低鐵 tol.	HvNAS1; HvNAAT-A; HvNAAT-B
稻米	gHvIDS3-1		低鐵 tol.	HvIDS3
稻米	gHvNAAT1		低鐵 tol.	HvNAAT-A; HvNAAT-B
稻米	gHvNAS1-1		低鐵 tol.	HvNAS1
稻米	NIA-OS006-4		疾病 res.	WRKY45
稻米	NIA-OS005-3		疾病 res.	WRKY45
稻米	NIA-OS004-2		疾病 res.	WRKY45
稻米	NIA-OS003-1		疾病 res.	WRKY45
稻米	NIA-OS002-9		疾病 res.	WRKY45
稻米	NIA-OS001-8		疾病 res.	WRKY45
稻米	OsCr11		抗過敏性	經修飾之 Cry j
稻米	17053		草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)
稻米	17314		草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)
玫瑰	WKS82 / 130-4-1	IFD-52401-4	經改良花色	5AT; bp40 (f3'5'h)
玫瑰	WKS92 / 130-9-1	IFD-52901-9	經改良花色	5AT; bp40 (f3'5'h)
黃豆	260-05 (G94-1, G94-19, G168)	NA	經改良油/脂肪酸	gm-fad2-1 (靜 默基因座)
黃豆	A2704-12	ACS-GM005-3	草銨膦 (Glufosinate) tol.	pat
黃豆	A2704-21	ACS-GM004-2	草銨膦 (Glufosinate) tol.	pat
黃豆	A5547-127	ACS-GM006-4	草銨膦 (Glufosinate) tol.	pat
黃豆	A5547-35	ACS-GM008-6	草銨膦 (Glufosinate) tol.	pat
黃豆	CV127	BPS-CV127-9	咪唑啉酮 tol.	csr1-2
黃豆	DAS68416-4	DAS68416-4	草銨膦 (Glufosinate) tol.	pat
黃豆	DP305423	DP-305423-1	經改良油/脂肪 酸；ALS 除草劑 tol.	gm-fad2-1 (靜 默基因座)； gm-hra
黃豆	DP356043	DP-356043-5	經改良油/脂肪 酸；草甘膦 (glyphosate) tol.	gm-fad2-1 (靜 默基因座)； gat4601
黃豆	FG72	MST-FG072-3	草甘膦	2mepsps;

黃豆	GTS 40-3-2 (40-3-2)	MON-04032-6	(Glyphosate)及 HPPD tol. 草甘膦	hppdPF W336
黃豆	GU262	ACS-GM003-1	(Glyphosate) tol. 草銨膦	cp4 epsps (aroA:CP4) pat
黃豆	MON87701	MON-87701-2	(Glufosinate) tol. 昆蟲 res.	cry1Ac
黃豆	MON87705	MON-87705-6	經改良油/脂肪 酸；草甘膦 (glyphosate) tol.	fatb1-A (正義 及反義)； fad2-1A (正義 及反義)；cp4 epsps (aroA:CP4)
黃豆	MON87708	MON-87708-9	麥草畏(Dicamba) 及草甘膦 (glyphosate) tol.	dmo; cp4 epsps (aroA:CP4)
黃豆	MON87769	MON-87769-7	經改良油/脂肪 酸；草甘膦 (glyphosate) tol.	Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA:CP4)
黃豆	MON89788	MON-89788-1	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)
黃豆	W62	ACS-GM002-9	草銨膦 (Glufosinate) tol.	bar
黃豆	W98	ACS-GM001-8	草銨膦 (Glufosinate) tol.	bar
黃豆	MON87754	MON-87754-1	高油脂	dgat2A
黃豆	DAS21606	DAS-21606	芳氧基烷酸酯及草 銨膦(glufosinate) tol.	經修飾之 aad- 12；pat
黃豆	DAS44406	DAS-44406-6	芳氧基烷酸酯、草 甘膦(glyphosate) 及草銨膦 (glufosinate) tol.	經修飾之 aad- 12；2mepsps； pat
黃豆	SYHT04R	SYN-0004R-8	硝草酮 ( Mesotrione ) tol.	經修飾之 avhppd
黃豆	9582.814.19.1		昆蟲 res.及草銨膦 (glufosinate) tol.	cry1Ac, cry1F, PAT
南瓜	CZW3	SEM-ØCZW3- 2	疾病 res.	cmv cp, zymv cp, wmv cp
南瓜	ZW20	SEM-0ZW20-7	疾病 res.	zymv cp, wmv cp
甜菜	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
甜菜	H7-1	KM-000H71-4	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)

甜菜	T120-7	ACS-BV001-3	草銨磷 (Glufosinate) tol.	pat
甜菜	T227-1		草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)
甘蔗	NXI-1T		乾旱 tol.	EcbetA
向日葵	X81359		咪唑啉酮 tol.	als
甜椒	PK-SP01	NA	疾病 res.	cmv cp
菸草	C/F/93/08-02	NA	苯腈(Oxynil) tol.	bxn
菸草	載體 21-41	NA	尼古丁減量	NtQPT1 (反 義)
番茄	1345-4	NA	延緩熟成/老化	acc (截短)
番茄	35-1-N	NA	延緩熟成/老化	sam-k
番茄	5345	NA	昆蟲 res.	cry1Ac
番茄	8338	CGN-89322-3	延緩熟成/老化	accd
番茄	B	SYN-0000B-6	延緩熟成/老化	pg (正義或反 義)
番茄	Da	SYN-0000DA- 9	延緩熟成/老化	pg (正義或反 義)
向日葵	X81359		咪唑啉酮 tol.	als
番茄	Da Dong No 9	NA	經改良產物	NA
番茄	F (1401F, h38F, 11013F,7913F)	SYN-0000F-1	延緩熟成/老化	pg (正義或反 義)
番茄	FLAVR SAVR™	CGN-89564-2	延緩熟成/老化	pg (正義或反 義)
番茄	Huafan No 1	NA	延緩熟成/老化	抗 efe
番茄	PK-TM8805R (8805R)	NA	疾病 res.	cmv cp
小麥	MON71800	MON-71800- 3	草甘膦 (Glyphosate) tol.	cp4 epsps (aroA:CP4)

\*阿根廷，\*\*波蘭，#茄子

**【0333】** 用本發明化合物處理基因改造植物與種子可能造成超加成性或協同效果。例如，在減少施用率、擴展活性範圍、增加對生物性/非生物性壓力的耐受性或增進儲存安定性上之效果，可能比施用本發明化合物在基因改造植物與種子上之單純加成反應所預期的更大。



**【0334】** 本發明之化合物亦可用於種子處理以保護種子免遭無脊椎動物害蟲侵害。在本揭露及申請專利範圍之內容中，處理種子表示將該種子接觸生物有效量之本發明化合物，其通常配製成本發明之組成物。此種子處理保護該種子免受無脊椎土壤害蟲侵害，通常也可保護與土壤接觸之從發芽種子發育出的幼苗的根部與其他植物部分。種子處理亦可透過本發明化合物或第二活性成分在發育植物內之位移，提供對葉子之保護。種子處理可應用於所有種類之種子，包括所發芽出之植物係經基因轉殖以表現特定性狀之種子。代表性實例包括該些表現對無脊椎動物害蟲有毒之蛋白質（像是蘇力菌毒素）之種子或該些表現除草劑抗性（像是草甘膦乙醯基轉換酶，其提供對草甘膦之抗性）之種子。以本發明化合物處理種子也可增強從該種子長出之植物的活力。

**【0335】** 一種種子處理方法係藉由在播撒種子之前以本發明之化合物（亦即，經配製之組成物）向種子噴霧或噴灑。經配製用於種子處理之組成物通常包含成膜劑或黏著劑。因此塗覆本發明組成物之種子通常包含生物有效量之式 1 化合物、其 *N*-氧化物或鹽類，以及成膜劑或黏著劑。可藉由直接噴灑可流動懸浮濃縮物至種子之滾動床以塗覆該種子，接著將種子乾燥。或者，可噴灑其他配方類型像是濕粉、溶液、懸浮乳劑、可乳化濃縮劑及水乳劑於種子上。此方法尤其適用於將膜塗層施用於種子上。各式不同的塗膜機與製程可供熟悉該項技術之人士所用。合適的製程包括該些列於 P. Kusters et al., *Seed*

*Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Monograph No. 57 及其中之參考文獻中之製程。

【0336】 式 1 化合物及彼等之組成物，無論是單獨或與其他殺蟲劑、殺線蟲劑及殺真菌劑組合，皆特別適用於處理作物種子，包括（但不限於）玉米（maize 或 corn）、黃豆、棉花、穀物（例如：小麥、燕麥、大麥、黑麥及稻米）、馬鈴薯、蔬菜及油菜。

【0337】 可與式 1 化合物配製成可用於種子處理之混合物之其他殺蟲劑包括阿巴汀（abamectin）、亞滅培（acetamiprid）、阿納寧（acrinathrin）、三亞蹠（amitraz）、阿佛菌素（avermectin）、印棟素（azadirachtin）、免速達（bensultap）、畢芬寧（bifenthrin）、布芬淨（buprofezin）、硫線磷（cadusafos）、加保利（carbaryl）、加保扶（carbofuran）、培丹（cartap）、剋安勃（chlorantraniliprole）、克凡派（chlorfenapyr）、陶斯松（chlorpyrifos）、可尼丁（clothianidin）、氰特破（cyantraniliprole）、賽扶寧（cyfluthrin）、 $\beta$ -賽扶寧（beta-cyfluthrin）、賽洛寧（cyhalothrin）、 $\gamma$ -賽洛寧（gamma-cyhalothrin）、 $\lambda$ -賽洛寧（lambda-cyhalothrin）、賽滅寧（cypermethrin）、 $\alpha$ -賽滅寧（alpha-cypermethrin）、 $\zeta$ -賽滅寧（zeta-cypermethrin）、賽滅淨（cyromazine）、第滅寧（deltamethrin）、地特靈（dieldrin）、達特南（dinotefuran）、苯蟲醚（diofenolan）、因滅汀（emamectin）、安殺番（endosulfan）、益化利（esfenvalerate）、乙蟲清（ethiprole）、依

芬寧 ( etofenprox ) 、 依殺蟎 ( etoxazole ) 、 芬硫克 ( fenothiocarb ) 、 芬諾克 ( fenoxycarb ) 、 芬化利 ( fenvalerate ) 、 芬普尼 ( fipronil ) 、 氟尼胺 ( flonicamid ) 、 氟蟲醯胺 ( flubendiamide ) 、 氟芬隆 ( flufenoxuron ) 、 福化利 ( fluvalinate ) 、 覆滅蟎 ( formetanate ) 、 福賽絕 ( fosthiazate ) 、 六伏隆 ( hexaflumuron ) 、 愛美松 ( hydramethylnon ) 、 益達胺 ( imidacloprid ) 、 因得克 ( indoxacarb ) 、 祿芬隆 ( lufenuron ) 、 美氟綜 ( metaflumizone ) 、 滅賜克 ( methiocarb ) 、 納乃得 ( methomyl ) 、 美賜平 ( methoprene ) 、 滅芬諾 ( methoxyfenozide ) 、 烯啶蟲胺 ( nitenpyram ) 、 尼殺賽 ( nithiazine ) 、 諾伐隆 ( novaluron ) 、 毆殺滅 ( oxamyl ) 、 派滅淨 ( pymetrozine ) 、 除蟲菊精 ( pyrethrin ) 、 畢達本 ( pyridaben ) 、 啶蟲丙醚 ( pyridalyl ) 、 百利普芬 ( pyriproxyfen ) 、 阿諾鹼 ( ryanodine ) 、 賜托拉 ( spinetoram ) 、 賜諾殺 ( spinosad ) 、 賜派芬 ( spirodiclofen ) 、 螺甲蟎酯 ( spiromesifen ) 、 螺蟲乙酯 ( spirotetramat ) 、 氟啶蟲胺腈 ( sulfoxaflor ) 、 得芬諾 ( tebufenozide ) 、 治滅寧 ( tetramethrin ) 、 噠蟲啉 ( thiacloprid ) 、 賽速安 ( thiamethoxam ) 、 硫敵克 ( thiodicarb ) 、 殺蟲單 ( thiosultap-sodium ) 、 泰滅寧 ( tralomethrin ) 、 啞蚜威 ( triazamate ) 、 三福隆 ( triflumuron ) 、 蘇力菌  $\delta$  內毒素、蘇力菌的所有品系及核多角體病毒的所有品系。

【0338】 可與式 1 化合物配製成可用於種子處理之混合物之殺真菌劑包括安美速 (amisulbrom)、亞托敏 (azoxystrobin)、白克列 (boscalid)、貝芬替 (carbendazim)、萎鏽靈 (carboxin)、克絕 (cymoxanil)、環克座 (cyproconazole)、待克利 (difenoconazole)、達滅芬 (dimethomorph)、扶吉胺 (fluazinam)、護汰寧 (fludioxonil)、氟喹唑 (fluquinconazole)、氟吡菌胺 (fluopicolide)、氟嘧菌酯 (fluoxastrobin)、護汰芬 (flutriafol)、巴斯夫 (fluxapyroxad)、依普克唑 (ipconazole)、依普同 (iprodisone)、滅達樂 (metalaxyl)、精甲霜靈 (mefenoxam)、滅特座 (metconazole)、邁克尼 (myclobutanil)、巴克素 (paclobutrazole)、賓福芬 (penflufen)、啞氧菌酯 (picoxystrobin)、丙硫菌唑 (prothioconazole)、百克敏 (pyraclostrobin)、賽達傷 (sedaxane)、硅噻菌胺 (silthiofam)、得克利 (tebuconazole)、腐絕 (thiabendazole)、甲基多保淨 (thiophanate-methyl)、得恩地 (thiram)、三氟敏 (trifloxystrobin) 及滅菌唑 (triticonazole)。

【0339】 可用於種子處理的包含式 1 化合物的組成物可進一步包含具有防治植物病原性真菌或細菌及/或土生動物如線蟲之有害影響的能力的細菌和真菌。具有殺線蟲特性的細菌包括但不限於強固芽孢桿菌 (*Bacillus firmus*)、仙人掌桿菌 (*Bacillus cereus*)、枯草桿菌 (*Bacillus subtilis*) 及穿透巴斯德芽孢菌 (*Pasteuria penetrans*)。合適強固芽孢桿菌 (*Bacillus firmus*) 菌株為 CNCM I-1582 (GB-126)，

其市售可得為 BioNem™。合適仙人掌桿菌(*Bacillus cereus*)菌株為 NCMM I-1592。二種桿菌菌株皆揭示於 US 6,406,690。其他具有殺線蟲活性的合適細菌為液化澱粉芽孢桿菌 (*B. amyloliquefaciens*) IN937a 及枯草桿菌 (*B. subtilis*) 菌株 GB03。具有殺真菌特性的細菌包括但不限於短小芽孢桿菌 (*B. pumilus*) 菌株 GB34。具有殺線蟲特性的真菌物種包括但不限於疣孢漆斑黴 (*Myrothecium verrucaria*)、淡紫擬青黴 (*Paecilomyces lilacinus*) 及淡紫紫孢菌 (*Purpureocillium lilacinum*)。

【0340】 種子處理亦可包括一或多個天然來源的殺線蟲劑，例如稱為哈拼 (harpin) 的誘導蛋白，其係分離自某些細菌性植物病原體如梨及蘋果火傷病菌 (*Erwinia amylovora*)。一個實例係 Harpin-N-Tek 種子處理技術，其可取得為 N-Hibit™ Gold CST。

【0341】 種子處理亦可包括一或多種豆類植物根瘤菌，例如微共生固氮細菌大豆根瘤菌 (*Bradyrhizobium japonicum*)。這些接種劑可視情況包括一或多種脂-幾丁寡醣 (lipo-chitooligosaccharides, LCOs)，其係在豆類植物的根部形成根瘤初期由根瘤菌所產生的根瘤 (NOD) 因子。例如，Optimize® 品牌的種子處理技術採用 LCO Promoter Technology™ 與接種劑之組合。

【0342】 種子處理亦可包括一或多種異黃酮，其可提高菌根菌 (mycorrhizal fungi) 的根部拓殖程度。菌根菌藉由加強根部吸收營養 (例如水、硫酸鹽、硝酸鹽、磷酸鹽及金屬) 來改善植物的生長情況。異黃酮的實例包括 (但不限於) 金雀異黃酮 (genistein)、鷹嘴

豆芽素 A (biochanin A)、刺芒柄花素 (formononetin)、大豆苷原 (daidzein)、黃豆素黃酮 (glycitein)、橙皮素 (hesperetin)、柚皮素 (naringenin) 及紅車軸草素 (pratensein)。刺芒柄花素 (formononetin) 可為菌根接種劑製品 (如 PHC Colonize® AG) 中的活性成分。

**【0343】** 種子處理亦可包括一或多個在植物接觸病原體後誘發系統性後天抗性(systemic acquired resistance)的植物活化劑。誘發該等保護機制的植物活化劑的一個實例係阿拉酸式苯-S-甲基。

**【0344】** 經處理之種子通常包含每 100 kg 種子約 0.1 g 至 1 kg (即處理前種子重量之約 0.0001%至 1%) 之量的本發明化合物。配製用於種子處理之可流動懸浮液通常包含約 0.5 至約 70%的活性成分、約 0.5 至約 30%的成膜黏著劑、約 0.5 至約 20%的分散劑、0 至約 5%的增稠劑、0 至約 5%的色素及/或染料、0 至約 2%的消泡劑、0 至約 1%的防腐劑與 0 至約 75%的揮發性液體稀釋劑。

**【0345】** 本發明之化合物可併入讓無脊椎動物害蟲取食或用於像是陷阱、誘餌台及類似之裝置中之誘餌組成物中。該誘餌組成物可呈粒劑形式，其包含：(a) 活性成分，亦即生物有效量之式 1 化合物、其 N-氧化物或其鹽類；(b) 一或多種食物材料；選擇性地 (c) 引誘劑；及選擇性地 (d) 一或多種保溼劑。值得注意的是包含約 0.001%至 5%的活性成分、約 40%至 99%的食物材料及/或引誘劑；及選擇性地約 0.05%至 10%的潤溼劑之粒劑或誘餌組成物，其在極低施用率下、尤其活性成分劑量為攝取致死而非直接接觸致死之劑量下，

可有效控制土壤無脊椎動物害蟲。有些食物材料可同時當作食物來源與引誘劑。食物材料包括碳水化合物、蛋白質及脂質。食物材料之實例為植物粉、糖、澱粉、動物脂肪、植物油、酵母萃取物及乳固體。引誘劑之實例為氣味劑及芳香劑，像是水果或植物萃取物、香水或其他動物或植物組分、費洛蒙或已知可吸引目標無脊椎動物害蟲之其他劑。濕潤劑（即保濕劑）的例子為乙二醇與其他聚醇、甘油與山梨醇。值得注意的是一種用以防治至少一種選自由螞蟻、白蟻及蟑螂所組成之群組之無脊椎動物害蟲的誘餌組成物（及一種利用此一誘餌組成物之方法）。用於防治無脊椎動物害蟲之裝置可包含本誘餌組成物及經調整以接收誘餌組成物的外殼，該外殼具有至少一個開口，其大小可讓無脊椎動物害蟲通過該開口，使無脊椎動物害蟲可從外殼以外的位置進入取食誘餌組成物，且該外殼進一步經調整為擺放在或靠近無脊椎動物害蟲的可能或已知活動處。

**【0346】** 本發明之一實施例係關於一種用於防治無脊椎動物害蟲的方法，其包含將本發明之殺害蟲組成物（一式 **1** 化合物與界面活性劑、固體稀釋劑及液體稀釋劑進行配製或式 **1** 化合物與至少一種其他殺蟲劑的配製混合物）以水稀釋，並視情況添加一佐劑以形成一稀釋組成物，以及使該無脊椎動物害蟲或其環境與有效量之該稀釋組成物接觸。

**【0347】** 雖然藉由用水稀釋足夠濃度的本發明殺蟲組成物所形成之噴霧組成物可提供防治無脊椎動物害蟲的足夠效力，亦可將分開配製的佐劑產品加至噴灑槽混合物中。該等額外的佐劑一般稱為「噴灑

佐劑」或「槽混合佐劑」，包括任何混合至噴灑槽中以改善殺蟲劑之表現或改變噴灑混合物之物理性質的物質。佐劑可為界面活性劑、乳化劑、以石油為基底的作物油、衍生自作物的種子油、酸化劑、緩衝劑、增稠劑或消泡劑。佐劑係用來增強效能（例如：生物可用性、黏附性、穿透性、覆蓋的均勻性及保護的耐久性），或減少或消除與不相容性、發泡、飄移、蒸發、揮發及降解有關的噴灑施用問題。為了獲得最佳性能，依據活性成分、配方及標的（例如，作物、害蟲）之特性選擇佐劑。

**【0348】** 在噴灑佐劑中，最常使用包括作物油、濃縮作物油、濃縮植物油及濃縮甲基籽油之油類，可能藉由促進更均勻一致之噴灑沉積以提高殺蟲劑療效。當考量植物毒性可能由油或其他不溶於水的液體引起的情況下，自本發明之組成物製備之噴灑組成物一般不會含有油基噴灑佐劑。然而，在油基噴霧佐劑所造成之植物毒性在商業上不重要的情況下，自本發明之組成物製備的噴霧組成物亦可含有油基噴霧佐劑，其可能可進一步增加對無脊椎動物害蟲的防治效果，以及耐雨能力。

**【0349】** 被稱為「作物油」之產品通常包含 95 至 98%石蠟或石腦油基石油，以及 1 至 2%之一或多種具乳化劑功能之界面活性劑。被稱為「濃縮作物油」之產品一般由 80%至 85%之以可乳化石油為基礎之油類及 15 至 20%之非離子性界面活性劑組成。被正確稱為「濃縮植物油」之產品通常由 80 至 85%之植物油（亦即種子或水果油，最常為棉籽油、亞麻子油、大豆油或葵花油）以及 15 至 20%之非離子



性界面活性劑組成。將植物油置換為通常源自植物油之脂肪酸甲酯可改良佐劑效能。甲基化籽油濃縮物的例子包括 MSO<sup>®</sup> Concentrate (UAP-Loveland Products, Inc.)與 Premium MSO Methylated Spray Oil (Helena Chemical Company)。

**【0350】** 添加至噴灑混合物之佐劑的量通常不超過約 2.5 體積%，更典型的量為約 0.1 至約 1 體積%。添加至噴灑混合物的佐劑之施用率一般在每公頃約 1 至 5 L 之間。噴灑佐劑的代表性實例包括：Adigor<sup>®</sup> (Syngenta) 47%在液態烴類中的甲基化油菜籽油、Silwet<sup>®</sup> (Helena Chemical Company) 經聚伸烷氧化物修飾之七甲基三矽氧烷及 Assist<sup>®</sup> (BASF) 17%界面活性劑摻合於 83%以石蠟為基底的礦物油。

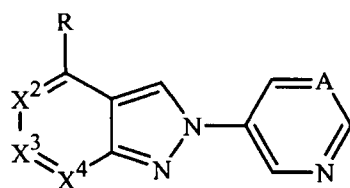
**【0351】** 本發明之化合物可在無其他佐劑的情況下施用，但最通常的施用為一配方，其包含一或多種活性成分及合適載劑、稀釋劑及界面活性劑，且視預期最終用途而定可能與食物組合。一種施用方法包括噴灑本發明化合物之水分散液或精製油液。與噴油、噴油濃縮物、散布黏著劑、佐劑、其他溶劑、及像是向日葵基丁氧化物之增效劑之組合通常可增強化合物功效。對於非農藝用途而言，該等噴霧可自諸如罐、瓶或其他容器之噴霧容器，藉助於泵或藉由使其自加壓容器（例如，加壓氣霧劑噴霧罐）釋放而施用。該等噴霧組成物可採用多種形式，例如噴霧、薄霧、泡沫、煙霧或霧。因此此噴霧組成物可進一步包含推進劑、發泡劑等視情況而定。值得注意的是包含生物有效量之本發明化合物或組成物及載劑的噴霧組成物。此類噴霧組成物

之一實施例包含生物有效量之本發明化合物或組成物及推進劑。代表性推進劑包括（但不限於）甲烷、乙烷、丙烷、丁烷、異丁烷、丁烯、戊烷、異戊烷、新戊烷、戊烯、氫氟碳化物、氯氟碳化物、二甲醚及前述物質之混合物。值得注意的是一種用以防治至少一種選自由下列所組成之群組之無脊椎動物害蟲的噴霧組成物（及一種利用自噴霧容器所施配之此類噴霧組成物的方法）：蚊子、黑蠅、廢蠅、鹿蠅、馬蠅、胡蜂、小黃蜂、大黃蜂、蜚、蜘蛛、螞蟻、蚋及其類似害蟲，包括個別或組合。

**【0352】** 下列測試顯示本發明化合物對特定害蟲的防治效力。「防治效力」代表抑制無脊椎動物害蟲之成長（包括死亡），此會造成明顯攝食減少。然而，該化合物提供之害蟲防治保護未限於這些物種。索引表 A 至 N 為對化合物的敘述。索引表 O 為  $^1\text{H}$  NMR 資料。

**【0353】** 以下縮寫用於下列索引表中：Cmpd 表示化合物，*t* 為三級，*c* 為環，Me 為甲基，Et 為乙基，Pr 為丙基，*i*-Pr 為異丙基，Bu 為丁基，*c*-Pr 為環丙基，*c*-Pn 為環戊基，*c*-Hx 為環己基，*t*-Bu 為三級丁基，Ph 為苯基，OMe 為甲氧基，SMe 為甲硫基，及 SO<sub>2</sub>Me 表示甲磺醯基。結構片段中之波狀線或「-」代表該片段連接至該分子其餘部分的連接點。縮寫「Ex.」表示「實例」，且其後之數字意指該化合物係於哪一個實例中製備。

## 索引表 A

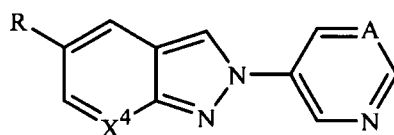


化合物 編號	R	X <sup>2</sup>	X <sup>3</sup>	X <sup>4</sup>	A	NMR/MS 資料
1	-C(O)(1-吡咯啉基)	CH	CH	CH	CH	*
2	-C(O)NH(2-嘧啶基)	CH	CH	CH	CH	*
3	-C(O)(嗎福林)	CH	CH	CH	CH	*
4	-C(O)NH(2-吡啶基)	CH	CH	CH	CH	*
5	-C(O)NH(苯基)	CH	CH	CH	CH	*
6	-C(O)NHCH(Me)C(O)NH(三級丁基)	CH	CH	CH	CH	*
7	-C(O)NHCH(Me)C(O)NH(異丙基)	CH	CH	CH	CH	*
8	-C(O)NH(異丙基)	CH	CH	CH	CH	*
9	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-吡啶基)	CH	CH	CH	CH	*
10	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	CH	CH	CH	CH	*
11	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-噻唑基)	CH	CH	CH	CH	*
12	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-呋喃基)	CH	CH	CH	CH	*
13	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SM <sub>e</sub>	CH	CH	CH	CH	*
14	-C(O)NH(環丙基)	CH	CH	CH	CH	*
15	-C(O)NH(1-哌啶基)	CH	CH	CH	CH	*
16	-C(O)NH(環己基)	CH	CH	CH	CH	*
17	3-(三氟甲基)-1-吡啶基	CH	CH	CH	CH	*
18	2-嘧啶基	CH	CH	CH	CH	*
19	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CH	*
20	6-(2-嘧啶基)吡啶-2-基	CH	CH	CH	CH	*
21	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-嘧啶基)	CH	CH	CH	CH	*
22	2-(2-吡啶基)噻唑-4-基	CH	CH	CH	CH	*
23	2-(2-噻唑基)噻唑-4-基	CH	CH	CH	CH	*
24	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH	CH	CH	CH	*
129	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-嘧啶基)	CH	N	CH	CF	*
130	-C(O)NH(異丙基)	CH	N	CH	CF	*
300	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-嘧啶基)	CH	CH	CH	CF	*
301	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	N	*
302	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-嘧啶基)	CH	CH	CH	N	*
303	1,2,4-【□+𠄎】二唑-3-基	CH	CH	CH	CH	*
304	5-(三氟甲基)-2-吡啶基	CH	CH	CH	CH	*
305	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡【□+井】基)	CH	CH	CH	CH	*
306	-C(S)NH(環己基)	CH	CH	CH	CH	*
307	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	CH	CH	CF	*

308	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-呋喃基)	CH	CH	CH	CF	*
309	-C(O)NH(異丙基)	CH	CH	CH	CF	*
310	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-嘧啶基)	CH	N	CH	CH	*
311	-C(O)NH(環丙基)	CH	N	CH	CH	*
312	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-呋喃基)	CH	N	CH	CH	*
313	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	CH	N	CH	CH	*
314	-C(O)NHCH(Me)(環丙基)	CH	N	CH	CH	*
315	2-硫基甲氧基-4-嘧啶基	CH	CH	CH	CH	*
316	-C(S)NH(異丙基)	CH	CH	CH	CH	*
500	-C(O)NH(異丙基)	CF	CH	CH	CH	299
501	-C(O)NH(異丙基)	CH	CH	CF	CH	299
502	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe	CH	CH	CF	CH	331
503	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe	CF	CH	CH	CH	331
504	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	CH	CH	CH	CF	*

\* <sup>1</sup>H NMR 資料見索引表 O。

### 索引表 B



X<sup>4</sup> 為 CH

化合物編號	R	A	NMR/MS 資料
25	-C(O)(1-吡咯啶基)	CH	*
26	-C(O)NH(2-嘧啶基)	CH	*
27	1-吡啶基	CH	*
28	-C(O)NH(2-吡啶基)	CH	*
29	-C(O)NH(苯基)	CH	*
30	-NHC(O)(苯基)	CH	*
31	-NHC(O)(2-吡啶基)	CH	*
32	-(R)-C(O)NHCH(Me)C(O)NH(三級丁基)	CH	*
33	-C(O)NMe <sub>2</sub>	CH	*
34	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	*
35	-C(O)NH(異丙基)	CH	*
36	-C(O)(1-哌啶基)	CH	*
37	-C(O)NH(環丙基)	CH	*
38	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH(-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-)	CH	*
39	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	CH	*
40	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-噻唑基)	CH	*

41	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-咪喃基)	CH	*
42	-C(O)NHNHCO <sub>2</sub> Me	CH	*
43	-C(O)(4-甲基-1-哌【口+井】基)	CH	*
44	-C(O)(嗎福林)	CH	*
45	-C(O)NHOCH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	CH	*
46	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SEt	CH	*
47	-C(O)NHOCH <sub>2</sub> (環丙基)	CH	*
48	-C(O)NHS(O) <sub>2</sub> (4-氯苯基)	CH	*
49	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CN	CH	*
50	-C(O)N(-CH <sub>2</sub> CH(CF <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	CH	*
51	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2,2-二氟環丙基)	CH	*
52	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	*
53	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (環丙基)	CH	*
54	-C(O)NHCH <sub>2</sub> C(Me)F <sub>2</sub>	CH	*
55	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-嘧啶基)	CH	*
56	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (6-溴-2-吡啶基)	CH	*
57	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe	CH	*
58	-C(O)N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe)(CH <sub>2</sub> OEt)	CH	*
59	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> (1-咪唑基)	CH	*
60	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-咪喃基)	CH	*
61	-C(O)N(Et)(環己基)	CH	*
62	-C(O)NH(3,3-二氟環丁基)	CH	*
63	-C(O)NHCH(異丙基)CO <sub>2</sub> Me	CH	*
64	-C(O)N(Me)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	*
65	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-噻吩基)	CH	*
66	-C(O)N(CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN)(CH <sub>2</sub> (3-吡啶基))	CH	*
67	-C(O)N(Me)(環丙基)	CH	*
68	-C(O)NHCH(Me)CH <sub>2</sub> OMe	CH	*
69	-C(O)N(CH <sub>2</sub> CCH) <sub>2</sub>	CH	*
70	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(異丙基) <sub>2</sub>	CH	*
71	-C(O)NHCH <sub>2</sub> ((3-三氟甲氧基)苯基)	CH	*
72	-C(O)N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(C(O)(環丙基))CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	CH	*
73	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2,2-二甲基-1,3-二氧五環烷-4-基)	CH	*
74	-C(O)N(-CH=NC(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	CH	*
75	-C(O)(硫基嗎福林)	CH	*
76	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (5-甲基-2-吡【口+井】基)	CH	*
131	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-咪喃基)	CF	*
132	-C(O)NHCH <sub>2</sub> C(Me)F <sub>2</sub>	CF	*
133	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	CF	*
134		CH	*
320	2-嘧啶基	CH	*
321	2-【口+罈】唑基	CH	*
322	5-(3-吡啶基)-1,2,4-【口+罈】二唑-3-基	CH	*

323	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	CH	*
324	2-吡【口+井】基	CH	*
325	3-吡啶基	CH	*
326	2-硫基甲氧基-4-嘧啶基	CH	*
327	6-氯-2-(SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et)-4-嘧啶基	CH	*
328	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	CH	*
329	-C(O)N(Me)CH <sub>2</sub> (2,2-二氟環丙基)	CH	343
330	-C(O)N(Me)CH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	CH	341
331	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	CH	297
332	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt	CH	311
333	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O(異丙基)	CH	325
334	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH(Me)OMe	CH	311
335	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	CH	311
336	-C(O)NH(3-甲氧基環丁基)	CH	323
338	-C(O)N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	CH	279
339	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me) <sub>2</sub>	CH	310
340	1,3,4-【口+罈】二唑-2-基	CH	*
341	2-(SCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et)-4-嘧啶基	CH	*
342	-C(O)NHNHCO <sub>2</sub> (三級丁基)	CH	*
343	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH	303
344	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	CH	285
345	-C(O)N(Me)Et	CH	281
346	-C(O)N(Me)Pr	CH	295
347	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-咪喃基)	CH	*
348	5-(三氟甲基)-2-吡啶基	CH	*
349	-C(S)NH <sub>2</sub>	CH	*
350	-C(O)NHMe	CH	253
351	-C(O)NHEt	CH	267
352	-C(O)NHPr	CH	281
353	-C(O)N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	CH	343
354	-C(O)NHBu	CH	295
355	2-噻唑啉基	CH	*
356	-NHC(O)(2-咪喃基)	CH	*
357	-NHC(O)CH <sub>2</sub> SPh	CH	*
358	-NHC(O)(環丙基)	CH	*
359	-NHC(O)CH <sub>2</sub> Ph	CH	*
360	-NHC(O)CH(Me)Et	CH	*
361	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (5-嘧啶基)	CH	*
362	-NHC(O)CH <sub>2</sub> CH(Me) <sub>2</sub>	CH	*
363	-C(O)NHNH(環己基)	CH	*
364	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-嘧啶基)	C(O) Me)	*
365	-C(O)NHCH(Me)CF <sub>3</sub>	CF	*
366	-C(O)NHCH(Me)(環丙基)	CF	*
367	-C(O)NHCH(CH <sub>2</sub> OMe) <sub>2</sub>	CF	*
368	-C(O)NHCH(異丙基)CF <sub>3</sub>	CF	*
369	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Et	CF	*
370	-C(O)NHCH(Me)CH <sub>2</sub> OMe	CF	*

371	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(三級丁基)	CH	*
372	-C(O)NHCH(Me)Et	CH	*
373	-C(O)NHNHC(O)(2-噻吩基)	CH	*
374	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (5-噻啉基)	CF	*
375	-C(O)NHNHCO <sub>2</sub> Me	CF	*
376	-C(O)NHNHC(O)(三級丁基)	CH	*
377	-C(O)NHNHC(O)(2-呋喃基)	CH	*
378	-C(O)NHNHC(O)苯基	CH	*
379	-C(O)NHNHC(O)CF <sub>3</sub>	CH	*
380	-C(O)NHNHCO <sub>2</sub> Me	N	*
381	-C(O)NHCH(-C(O)SCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	CH	*
382	-C(O)N(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	CF	*
383	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-苯并咪唑)	CF	*
384	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH(-CH <sub>2</sub> N(CO <sub>2</sub> (三級丁基))CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	CF	*
385	-C(O)NHNHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	*
386	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-呋喃基)	N	*
387	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	N	*
388	-C(O)NH(環丙基)	N	*
389	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-呋喃基)	CCl	*
390	-C(O)NH(環丙基)	CCl	*
391	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CCl	*
392	-NHC(O)CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	*
393	-C(O)NHNH(環丙基)	CH	*
394	-C(O)NHC(Me) <sub>2</sub> C≡CH	CH	*
395	-C(O)NH(環丁基)	CH	*
396	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-呋喃基)	CBr	*
397	-C(O)NHNHCO <sub>2</sub> Me	CBr	*
398	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CBr	*
399	-C(O)NH(環丙基)	CBr	*
400	-C(O)NHNHC(O)(3-吡啶基)	CH	*
401	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF	*
402	-C(O)NHC(-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)CO <sub>2</sub> Me	CH	*
403	-C(O)NHCH(Et)CH <sub>2</sub> OMe	CH	*
404	-C(O)NHCH <sub>2</sub> C≡CH	CH	*
405	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	C(O) Me)	*
406	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-呋喃基)	C(O) Me)	*
407	-C(O)NH(環丙基)	C(O) Me)	*
408	-C(O)NHNHCO <sub>2</sub> Me	C(O) Me)	*
409	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (5-噻啉基)	N	*
410	-C(O)NH(環丙基)	CF	*
411	-C(O)NHCH(Me)CF <sub>3</sub>	CH	*
412	-C(O)NHCH(異丙基)CF <sub>3</sub>	CH	*
413	-C(O)N(Et) <sub>2</sub>	CH	*

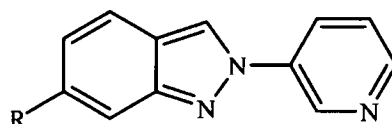
414	-C(O)NHCH(環丙基)(4-甲氧苯基)	CH	*
415	-C(O)NHCH(Me)(環丙基)	CH	*
416	-C(O)NHNHC(S)NH(異丙基)	CH	*
417	-C(O)NHC(Me)2CF3	CH	349
418	-C(O)NHC(-CH2CH2-)CF3	CH	347
419	-C(O)NHCH2(2-吡啶基)	CH	330
420	-C(O)NHCH2CH(Cl)CH2CH2CH2Cl	CH	*
421	-C(O)NHCH2(四氫-2-呋喃基)	C(S Me)	*
422	2-(SCH2CF3)嘧啶-4-基	CH	*
423	6-(2-嘧啶基)吡啶-2-基	CH	*
424	5-(三氟甲基)吡【口+井】-2-基	CH	*
425	-C(O)NHCH2CH2SCH2CH2CF3	CH	395
426	-C(O)NHCH2CH2SCH2CF3	CH	381
427	-C(O)NHCH2CH2S(O)2CH2CH2CF3	CH	427

X<sup>4</sup> 為 N

化合物編號	R	A	NMR/MS 資料
173	-C(O)NHCH2(四氫-2-呋喃基)	CH	*

\* <sup>1</sup>H NMR 資料見索引表 O。

索引表 C

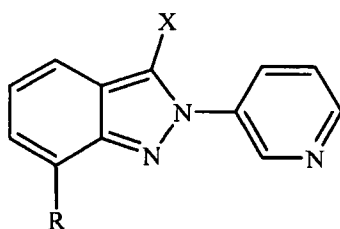


化合物編號	R	A	NMR/MS 資料
428	-C(O)NHCH2CF3	CH	*
429	-C(O)NH(環丙基)	CH	*
430	-C(O)NHCH2(2-嘧啶基)	CH	*
431	-C(O)NHNHCO2Me	CH	*
432	-C(O)NHCH2CH2SMe	CH	*
433	-C(O)NHCH2CH(OMe)2	CH	*
434	-C(O)NHCH(Me)CF3	CH	*
435	-C(O)NHCH2CHF2	CH	*
436	-C(O)NHCH(CH2OMe)2	CH	*
437	-C(O)NHCH2(四氫-2-呋喃基)	CH	*

\* <sup>1</sup>H NMR 資料見索引表 O。

索引表 D

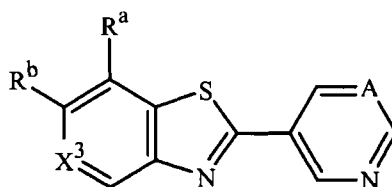




化合物編號	R	X	NMR/MS 資料
135	-C(O)NHNHCO <sub>2</sub> Me	Cl	*
136	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	*
137	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-嘧啶基)	Cl	*
142	-C(O)NH(環丙基)	H	*
438	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-呋喃基)	Cl	*

\* <sup>1</sup>H NMR 資料見索引表 O。

### 索引表 E

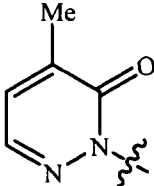


R<sup>b</sup> 為 H

化合物編號	R <sup>a</sup>	X <sup>3</sup>	A	NMR/MS 資料
77	-C(O)(1-吡咯啶基)	CH	CH	*
78	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	CH	*
79	-C(O)N(Me) <sub>2</sub>	CH	CH	*
80	-C(O)NH(2-嘧啶基)	CH	CH	*
81	-C(O)NH(異丙基)	CH	CH	*
82	-NHC(O)O(三級丁基)	CH	CH	*
83	-NHC(O)(2-吡啶基)	CH	CH	*
84	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe	CH	CH	*
85	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> S(三級丁基)	CH	CH	*
160	-C(O)NH(環丁基)	CH	CH	*
161	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-呋喃基)	CH	CH	*
162	-C(O)NHNHCO <sub>2</sub> Me	CH	CH	*
163	-C(O)NH(環丙基)	CH	CH	*

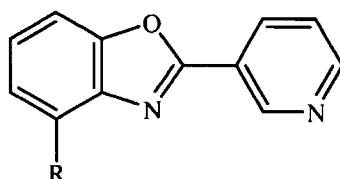
R<sup>a</sup> 為 H

化合物編號	R <sup>b</sup>	X <sup>3</sup>	A	NMR/MS 資料
86	3-(三氟甲基)吡啶-1-基	CH	CH	*
87	2-氟苯基	CH	CH	*
88	-C(O)NH(異丙基)	CH	CH	*
89	-C(O)NH(1-吡咯啉基)	CH	CH	*
90	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	CH	*
91	-C(O)N(Me)(異丙基)	CH	CH	*
92	- (R)-C(O)NHCH(Me)C(O)NH(三級丁基)	CH	CH	*
93	-C(O)NH(環丙基)	CH	CH	*
94	-C(O)NH(環戊基)	CH	CH	*
95	-C(O)NHCH <sub>2</sub> Si(Me) <sub>3</sub>	CH	CH	*
96	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe	CH	CH	*
97	-C(O)NHC(Me) <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe	CH	CH	*
98	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH(-OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O-)	CH	CH	*
99	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHC(O)Me	CH	CH	*
100	-C(O)NHCH(-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -)	CH	CH	*
101	-C(O)NHC(Me) <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	CH	*
102	-C(O)NHCH <sub>2</sub> C(O)NHCH <sub>2</sub> C(O)NHEt	CH	CH	*
103	-C(O)NH(3,3-二氟環丁基)	CH	CH	*
104	-C(O)NHCH(Me)CF <sub>3</sub>	CH	CH	*
105	吡啶-1-基	CH	CH	*
106	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-吡啶基)	CH	CH	*
107	-C(O)(2-(三氟甲基)吡咯啉-1-基)	CH	CH	*
108	-C(O)(2-(2-吡啶基)吡咯啉-1-基)	CH	CH	*
109	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (6-溴-2-吡啶基)	CH	CH	*
110	-C(O)NHCH(Me)(3,5-二氯-2-吡啶基)	CH	CH	*
111	- (R)-C(O)NHCH(Me)C(O)NH(Et)	CH	CH	*
112	- (R)-C(O)NHCH(Me)C(O)NH(異丙基)	CH	CH	*
113	- (R)-C(O)NHCH(Me)C(O)NH(CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> )	CH	CH	*
114	3-甲基-1,2,4-【口+罈】二唑-5-基	CH	CH	*
115	-NHC(O)O(三級丁基)	CH	CH	*
116	-C(O)NH <sub>2</sub>	CH	CH	*
117	-NHC(O)N(Et) <sub>2</sub>	CH	CH	*
118	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-嘧啶基)	CH	CH	*
119	1,2,4-三唑-1-基	CH	CH	*
120		CH	CH	*
121	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe	CH	CF	*

122	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-呋喃基)	CH	CF	*
123	-C(O)NHCH(Me)CH <sub>2</sub> OMe	CH	CF	*
124	-C(O)NH(Et)	CH	CF	*
125	-C(O)(1-吡咯啉基)	CH	CF	*
126	-C(O)NH(異丙基)	CH	CF	*
127	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	CF	*
128		CH	CH	*

\* <sup>1</sup>H NMR 資料見索引表 O。

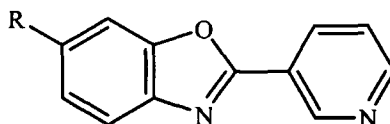
### 索引表 F



化合物編號	R	NMR/MS 資料
138	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-噁啉基)	*
139	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-呋喃基)	*
140	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	*
141	-C(O)NH(環丙基)	*

\* <sup>1</sup>H NMR 資料見索引表 O。

### 索引表 G

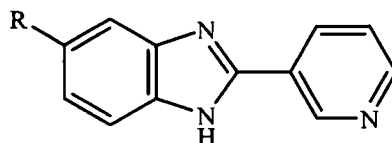


化合物編號	R	NMR/MS 資料
158	-NHC(O)(環丁基)	*
159	-NHC(O)(環丙基)	*
439	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2-噁啉基)	*
440	-C(O)NH(四氫-2-呋喃基)	*
441	-C(O)NH(異丙基)	*
442	-C(O)N(Pr)CH <sub>2</sub> (環丙基)	*
443	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	*
444	-C(O)N(Me)(環丙基)	*

445	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	*
446	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (環丙基)	*
447	-C(O)NH(環丙基)	*
448	-C(O)NHNHCO <sub>2</sub> Me	*
449	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	*

\* <sup>1</sup>H NMR 資料見索引表 O。

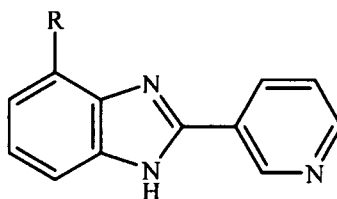
### 索引表 H



化合物編號	R	NMR/MS 資料
200	-C(O)(1-吡咯啉基)	*
201	-C(O)NH(異丙基)	*

\* <sup>1</sup>H NMR 資料見索引表 O。

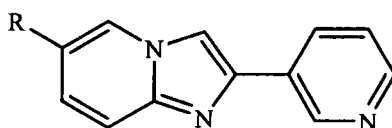
### 索引表 I



化合物編號	R	NMR/MS 資料
450	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SMe	*
451	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	*
452	-C(O)N(Me) <sub>2</sub>	*
453	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	*
454	-C(O)NH(三級丁基)	*

\* <sup>1</sup>H NMR 資料見索引表 O。

### 索引表 J

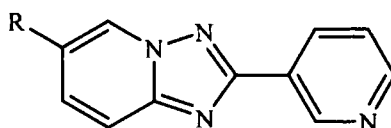


化合物編號	R	NMR/MS 資料
-------	---	-----------

455	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CH(OMe) <sub>2</sub>	327
456	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-呋喃基)	323
457	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	321
458	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (2,2-二氟環丙基)	329

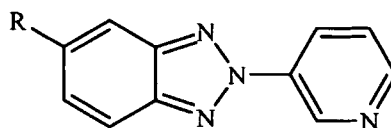
\* <sup>1</sup>H NMR 資料見索引表 O。

## 索引表 K



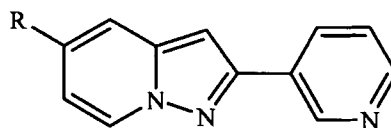
化合物編號	R	MS 資料
459	-C(O)NHNHCO <sub>2</sub> Me	313
460	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	322.5

## 索引表 L



化合物編號	R	MS 資料
461	-C(O)NHCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	322.5

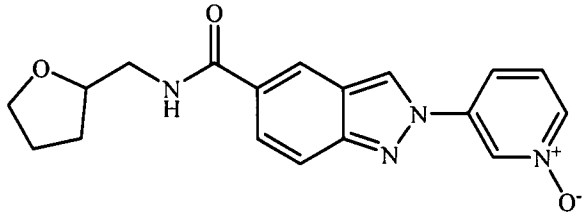
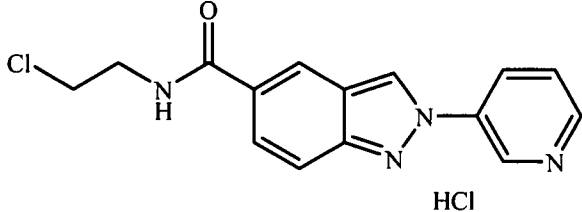
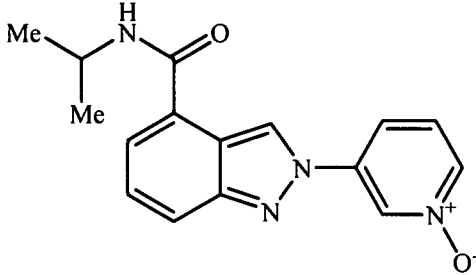
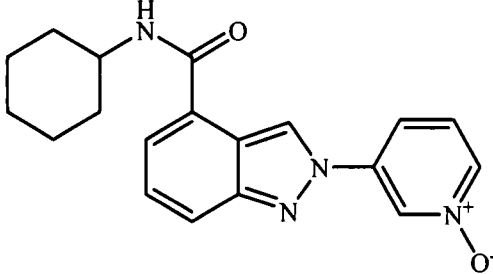
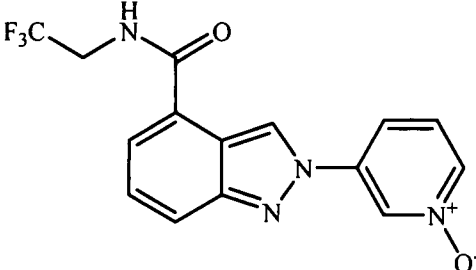
## 索引表 M



化合物編號	R	MS 資料
467	-C(O)NHCH <sub>2</sub> (四氫-2-呋喃基)	*

\* <sup>1</sup>H NMR 資料見索引表 O。

## 索引表 N

化合物編號	結構	NMR/MS 資料
462		*
463		*
464		*
465		*
466		*

\* <sup>1</sup>H NMR 資料見索引表 O。

## 索引表 O

化合物編號	<sup>1</sup> H NMR 資料 <sup>a</sup>
1	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.23 (s, 1H), 8.74 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.66 (dd, J=4.7, 1.6 Hz, 1H), 8.28 (ddd, J=8.3, 2.6, 1.5 Hz, 1H), 7.85 (dt, J=8.7, 0.9 Hz, 1H), 7.47-7.50 (m, 1H), 7.35 (dd, J=8.7, 6.8 Hz, 1H), 7.28-7.30 (m, 1H), 3.75 (br s, 2H), 3.59 (br s, 2H), 1.97-2.04 (br s, 2H), 1.92 (br s, 2H)
2	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.27 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.25 (s, 1H), 9.0 (s, 1H), 8.72 (d, J=4.9 Hz, 2H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.28-8.33 (m, 1H), 8.05 (d, J=24.1 Hz, 1H), 7.69 (d, J=6.8 Hz, 1H), 7.52 (m, 1H), 7.44 (dd, J=8.7, 6.9 Hz, 1H), 7.12 (t, J=4.9 Hz, 1H)
3	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.22 (s, 1H), 8.69 (d, J=3.8 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.25-8.32 (m, 1H), 7.87 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.50 (dd, J=8.4, 4.7 Hz, 1H), 7.36 (dd, J=8.8, 6.8 Hz, 1H), 7.17 (d, J=6.8, 1H), 3.72-3.82 (m, 4H)
4	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.28 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.14 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.96-9.00 (m, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.42 (dt, J=8.4, 0.9 Hz, 1H), 8.30-8.33 (m, 1H), 8.01 (dd, J=8.7, 0.7 Hz, 1H), 7.80 (dd, J=1.9, 1.1 Hz, 1H), 7.67 (d, J=6.9 Hz, 1H), 7.49-7.52 (m, 1H), 7.42 (dd, J=8.7, 6.9 Hz, 1H), 7.08-7.12 (m, 1H)
5	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.27 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.12 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.68 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.28-8.31 (m, 1H), 8.02-8.06 (br s, 1H), 8.00 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.69 (d, J=8.6 Hz, 2H), 7.57 (d, J=6.8 Hz, 1H), 7.48-7.52 (m, 1H), 7.42 (dd, J=8.5, 7.3 Hz, 3H), 7.21 (t, J=24.1 Hz, 1H)
6	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.26 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.07 (s, 1H), 8.68 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.29-8.34 (m, 1H), 7.95 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.49-7.54 (m, 2H), 7.35-7.41 (m, 1H), 7.10-7.16 (m, 1H), 4.55-4.66 (m, 1H), 1.52 (d, J=6.9 Hz, 3H), 1.39 (s, 9H)
7	<sup>1</sup> H NMR (丙酮-d <sub>6</sub> ) δ:9.35 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.32 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.67 (d, J=9.8 Hz, 1H), 8.51-8.57 (m, 1H), 8.48 (d, J=14.3 Hz, 1H), 7.93 (d, J=14.7 Hz, 1H), 7.79 (d, J=7.4 Hz, 1H), 7.77 (d, J=6.5 Hz, 1H), 7.62-7.69 (m, 1H), 7.44 (dd, J=8.7, 6.9 Hz, 1H), 4.49-4.58 (m, 1H), 3.83-3.92 (m, 1H), 1.37 (d, J=7.3 Hz, 3H), 1.06-1.10 (m, 6H)
8	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.26 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.09 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.67 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.29 (ddd, J=8.3, 2.6, 1.4 Hz, 1H), 7.92 (dt, J=8.5, 0.9 Hz, 1H), 7.48 (m, 1H), 7.31-7.41 (m, 2H), 6.15 (s, 1H), 4.31-4.41 (m, 1H), 1.33 (d, J=6.6 Hz, 6H)
9	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.27 (d, J=10.1 Hz, 1H), 9.17 (s, 1H), 8.68 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.59-8.64 (m, 1H), 8.30-8.35 (m, 1H), 7.96 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.81 (br. s, 1H), 7.72 (t, J=18.8 Hz, 1H), 7.62 (d, J=6.9 Hz, 1H), 7.48-7.52 (m, 1H), 7.40 (dd, J=8.8, 6.9 Hz, 1H), 7.37 (d, J=7.9 Hz, 1H), 4.85 (d, J=4.9 Hz, 2H)
10	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.26 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.08 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.68 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.26-8.36 (m, 1H), 7.95 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.50 (dd, J=8.3, 4.8 Hz, 1H), 7.45 (d, J=6.6 Hz, 1H), 7.37 (dd, J=8.7, 6.9 Hz, 1H), 6.51 (br. s., 1H), 4.55 (t, J=5.2 Hz, 1H), 3.69 (t, J=5.5 Hz, 2H), 3.48 (s, 6H)
11	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.25 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.12 (d, J=0.6 Hz, 1H), 8.66 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.30 (d, J=20.3 Hz, 1H), 7.94 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.76 (d, J=3.2 Hz, 1H), 7.54 (d, J=6.9 Hz, 1H), 7.44-7.51 (m, 2H), 7.34 (d, J=3.3 Hz, 2H), 5.03 (d, J=5.5 Hz, 2H)

12	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.26 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.09 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.67 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.26-8.35 (m, 1H), 7.94 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.47 (dd, J=42.1, 6.8 Hz, 2H), 7.37 (dd, J=32.6, 8.7 Hz, 1H), 6.82 (br. s, 1H), 4.09-4.19 (m, 1H), 3.78-3.99 (m, 3H), 3.35-3.46 (m, 1H), 2.03-2.15 (m, 1H), 1.96 (t, J=7.3 Hz, 2H), 1.66 (ddd, J=59.9, 12.3, 8.2 Hz, 1H)
13	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.26 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.10 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.68 (dd, J=4.7, 1.6 Hz, 1H), 8.26-8.33 (m, 1H), 7.95 (d, J=21.0 Hz, 1H), 7.45-7.54 (m, 2H), 7.37 (dd, J=8.7, 6.9 Hz, 1H), 6.83 (br. s, 1H), 3.75 (dd, J=39.1, 33.7 Hz, 2H), 2.83 (t, J=27.4 Hz, 2H), 2.18 (s, 3H)
14	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.26 (d, J=2.0 Hz, 1H), 9.12 (d, J=0.6 Hz, 1H), 8.67 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.29 (ddd, J=8.3, 2.6, 1.5 Hz, 1H), 7.93 (d, J=18.0 Hz, 1H), 7.50 (ddd, J=8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.29-7.38 (m, 2H), 6.50 (br. s., 1H), 2.91-3.02 (m, 1H), 0.93 (dd, J=32.8, 27.3 Hz, 2H), 0.69 (d, J=27.7 Hz, 2H)
15	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.67 (dd, J=4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.57 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.27 (d, J=17.5 Hz, 1H), 7.84 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.49 (ddd, J=8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.35 (dd, J=27.1, 19.9 Hz, 1H), 7.15 (d, J=21.8 Hz, 1H), 3.49 (s, 5H), 1.47-1.71 (m, 5H)
16	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.26 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.09 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.68 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.27-8.32 (m, 1H), 7.93 (dt, J=8.0, 1.1 Hz, 1H), 7.49 (ddd, J=8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.33-7.40 (m, 2H), 6.15 (br s, 1H), 4.05 (dd, J=38.3, 8.0 Hz, 1H), 2.10 (dd, J=12.5, 3.5 Hz, 2H), 1.80 (dd, J=26.8, 13.9 Hz, 2H), 1.66-1.74 (m, 1H), 1.48 (dd, J=47.4, 13.6 Hz, 2H), 1.22-1.38 (m, 3H)
17	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.26 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.05 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.71 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.27-8.35 (m, 1H), 8.13 (dd, J=2.4, 0.9 Hz, 1H), 7.80 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.52 (ddd, J=8.2, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.39 (dd, J=8.7, 7.3 Hz, 1H), 7.22-7.28 (m, 1H), 6.80 (d, J=2.5 Hz, 1H)
18	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.47 (d, J=0.9 Hz, 1H), 9.31 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.90 (d, J=4.9 Hz, 2H), 8.68 (d, J=20.8 Hz, 1H), 8.44 (d, J=19.4 Hz, 1H), 8.35-8.40 (m, 1H), 7.95 (d, J=27.0 Hz, 1H), 7.51 (t, J=16.6 Hz, 2H), 7.23 (t, J=4.8 Hz, 1H)
19	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.28 (d, J=19.9 Hz, 1H), 9.06 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.65-8.75 (m, 1H), 8.25-8.35 (m, 1H), 8.02 (d, J=27.4 Hz, 1H), 7.45-7.56 (m, 2H), 7.36-7.44 (m, 1H), 6.56 (br s, 1H), 4.16-4.28 (m, 2H)
20	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:10.44 (d, J=0.9 Hz, 1H), 9.43 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.02 (d, J=4.7 Hz, 2H), 8.67 (d, J=12.0 Hz, 1H), 8.50-8.53 (m, 1H), 8.48 (dd, J=7.7, 0.8 Hz, 1H), 8.09 (d, J=7.4 Hz, 1H), 8.00 (t, J=21.4 Hz, 1H), 8.01 (d, J=18.0 Hz, 1H), 7.76 (d, J=6.9 Hz, 1H), 7.50-7.55 (m, 1H), 7.44-7.49 (m, 1H), 7.39 (t, J=16.9 Hz, 1H)
21	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.39 (d, J=0.8 Hz, 1H), 9.36 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.14 (t, J=5.9 Hz, 1H), 8.79 (d, J=4.9 Hz, 2H), 8.67 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.50-8.57 (m, 1H), 7.96 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.80 (d, J=6.5 Hz, 1H), 7.64 (ddd, J=8.4, 4.7, 0.8 Hz, 1H), 7.47 (dd, J=8.8, 6.9 Hz, 1H), 7.41 (t, J=4.9 Hz, 1H), 4.76 (d, J=6.0 Hz, 2H)



22	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.26-9.33 (m, 1H), 9.23 (s, 1H), 8.62-8.76 (m, 2H), 8.40 (d, J=19.7 Hz, 1H), 8.32 (d, J=18.9 Hz, 1H), 7.90 (t, J=28.4 Hz, 1H), 7.77-7.85 (m, J=32.5 Hz, 2H), 7.65 (d, J=18.1 Hz, 1H), 7.50-7.59 (m, 1H), 7.45 (t, J=27.3 Hz, 1H), 7.37-7.41 (m, 1H)
23	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.27 (d, J=10.6 Hz, 1H), 9.23 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.66-8.72 (m, 2H), 8.39 (d, J=19.4 Hz, 1H), 8.33 (d, J=7.7 Hz, 1H), 7.89 (dd, J=13.6, 1.4 Hz, 1H), 7.83 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.63 (d, J=6.5 Hz, 1H), 7.51-7.56 (m, 1H), 7.45 (dd, J=15.8, 1.7 Hz, 1H), 7.36-7.41 (m, 1H)
24	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.41 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.26 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.51-8.58 (m, 1H), 8.24 (br s, 1H), 7.94 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.74 (d, J=6.9 Hz, 1H), 7.62-7.69 (m, 1H), 7.43 (dd, J=8.7, 6.9 Hz, 1H), 6.01-6.31 (m, J=112.9 Hz, 1H), 3.80-3.96 (m, 2H),
25	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.68 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.27-8.32 (m, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.79 (d, J=21.8 Hz, 1H), 7.48-7.54 (m, 2H), 3.69 (t, J=6.8 Hz, 2H), 3.52 (t, J=6.3 Hz, 2H), 1.95-2.03 (t, J=6.2 Hz, 2H), 1.91 (t, J=6.5 Hz, 2H)
26	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.22 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.79 (s, 1H), 8.72 (dd, J=9.8, 1.0 Hz, 1H), 8.69 (d, J=4.9 Hz, 2H), 8.63 (s, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.29-8.34 (m, 1H), 7.88 (d, J=1.3 Hz, 2H), 7.51-7.56 (m, 1H), 7.08 (t, J=4.8 Hz, 1H)
27	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (br s, 1H), 8.69 (d, J=4.1 Hz, 1H), 8.51 (s, 1H), 8.30 (d, J=22.1 Hz, 1H), 7.97 (d, J=1.7 Hz, 2H), 7.89 (d, J=9.3 Hz, 1H), 7.78-7.82 (m, 1H), 7.78-7.82 (m, 2H), 7.51 (dd, J=8.2, 4.7 Hz, 1H), 6.50 (t, J=9.1 Hz, 1H)
28	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.23 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.72 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.44 (t, J=1.3 Hz, 1H), 8.42 (d, J=10.9 Hz, 1H), 8.31-8.34 (m, 2H), 7.88-7.90 (m, 2H), 7.75-7.83 (m, 1H), 7.50-7.58 (m, 1H), 7.10 (ddd, J=7.3, 4.9, 1.0 Hz, 1H)
29	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.22 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.71 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.29-8.35 (m, 1H), 7.88 (d, J=0.8 Hz, 2H), 7.81 (d, J=15.9 Hz, 1H), 7.68 (d, J=18.1 Hz, 2H), 7.54 (dd, J=18.8, 8.4 Hz, 1H), 7.41 (t, J=8.4 Hz, 3H), 7.18 (t, J=20.3 Hz, 2H)
30	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.32 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.14 (s, 1H), 9.09 (s, 1H), 8.64 (d, J=7.7 Hz, 1H), 8.44-8.50 (m, 1H), 8.16 (d, J=11.5 Hz, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.95 (d, J=10.4 Hz, 1H), 7.82 (t, J=24.7 Hz, 1H), 7.72 (d, J=10.7 Hz, 1H), 7.61-7.68 (m, 2H), 7.51 (d, J=20.2 Hz, 1H), 7.28 (d, J=13.9 Hz, 1H)
31	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.32 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.29-9.31 (m, 1H), 9.28-9.31 (m, 1H), 9.08 (s, 1H), 8.63 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.45-8.50 (m, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.68 (d, J=9.3 Hz, 1H), 7.61-7.66 (m, 2H), 7.34-7.42 (m, 1H), 7.12 (br. s, 2H)
32	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.26 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.68 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.95 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.49-7.54 (m, 2H), 7.35-7.41 (m, 1H), 7.10-7.16 (m, 1H), 4.55-4.66 (m, 1H), 1.52 (d, J=6.9 Hz, 3H), 1.39 (s, 9H)

33	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (br s, 1H), 8.70 (d, J=12.0 Hz, 1H), 8.53 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.27-8.33 (m, 1H), 7.85-7.88 (m, 1H), 7.81 (d, J=15.6 Hz, 1H), 7.50-7.55 (m, 1H), 7.40 (dd, J=9.0, 1.6 Hz, 1H), 3.03-3.23 (m, 6H)
34	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, J=4.8, 1.5 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.32 (dd, J=1.7, 1.0 Hz, 1H), 8.29-8.32 (m, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.85 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.72 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 7.51-7.55 (m, 1H), 6.47 (br s, 1H), 4.12-4.26 (m, 2H)
35	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (br s, 1H), 8.70 (d, J=3.6 Hz, 1H), 8.57 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.28-8.33 (m, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.81 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.69 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 7.49-7.56 (m, 1H), 5.98 (br s, 1H), 4.26-4.44 (m, 1H), 1.31 (d, J=6.6 Hz, 6H)
36	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.27-8.32 (m, 1H), 7.83 (dd, J=9.6, 3.3 Hz, 1H), 7.79-7.82 (m, 1H), 7.52 (dd, J=19.7, 4.1 Hz, 1H), 7.37 (dd, J=9.0, 1.6 Hz, 1H), 3.45-3.74 (m, 5H), 1.51-1.70 (m, 5H)
37	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.35 (d, J=2.7 Hz, 1H), 9.15 (s, 1H), 8.68 (d, J=17.7 Hz, 1H), 8.47-8.52 (m, 1H), 8.36 (s, 1H), 7.84 (d, J=13.4 Hz, 1H), 7.74 (d, J=11.7 Hz, 1H), 7.61-7.68 (m, 1H), 2.93-3.00 (m, 1H), 0.71-0.80 (m, 2H), 0.61-0.68 (m, 2H)
38	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.35 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.16 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.68 (dd, J=4.6, 1.4 Hz, 1H), 8.47-8.52 (m, 1H), 8.44 (dd, J=1.6, 0.9 Hz, 1H), 7.88 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.77 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.61-7.67 (m, 1H), 5.06 (s, 1H), 3.98-4.01 (m, 1H), (m, 2H), 2.8 (br s, 4H)
39	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.7 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.58 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.29-8.32 (m, 1H), 8.28 (dd, J=1.7, 1.0 Hz, 1H), 7.82 (dt, J=9.0, 0.9 Hz, 1H), 7.71 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 7.50-7.54 (m, 1H), 6.40-6.45 (m, 1H), 4.54 (t, J=5.2 Hz, 1H), 3.66 (t, J=5.5 Hz, 2H), 3.47 (s, 6H)
40	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.36 (d, J=2.7 Hz, 1H), 9.19 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.68 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.61 (br s, 1H), 8.50-8.52 (m, 1H), 8.49 (dd, J=2.6, 1.5 Hz, 1H), 7.93 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.80 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.71 (d, J=3.3 Hz, 1H), 7.62-7.66 (m, 1H), 7.51 (d, J=3.2 Hz, 1H), 4.92 (d, J=6.0 Hz, 2H)
41	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (br s, 1H), 8.70 (d, J=2.8 Hz, 1H), 8.57 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.31 (s, 1H), 8.28-8.30 (m, 2H), 7.82 (d, J=12.6 Hz, 1H), 7.73 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 7.52 (dd, J=8.2, 4.7 Hz, 1H), 6.61 (br s, 1H), 3.92 (dt, J=8.4, 6.7 Hz, 1H), 3.77-3.89 (m, 2H), 3.33-3.44 (m, 1H), 2.05 (d, J=43.0 Hz, 1H), 1.90-2.01 (m, 2H), 1.72-1.79 (m, 1H), 1.60-1.71 (m, 1H)
42	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.60 (s, 1H), 9.36 (d, J=2.7 Hz, 1H), 9.20 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.69 (d, J=11.5 Hz, 1H), 8.48-8.52 (m, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.26 (br s, 1H), 7.87 (d, J=16.6 Hz, 1H), 7.81 (d, J=16.6 Hz, 1H), 7.62-7.67 (m, 1H), 3.70 (s, 3H)
43	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.29 (ddd, J=8.3, 2.6, 1.6 Hz, 1H), 7.84-7.87 (m, 1H), 7.81 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.49-7.55 (m, 1H), 7.38 (dd, J=9.0, 1.6 Hz, 1H), 3.66 (br s, 4H), 2.46 (br. s, 4H), 2.35 (s, 3H)

44	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.55 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.29 (ddd, J=8.3, 2.7, 1.5 Hz, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.82 (dt, J=8.9, 0.9 Hz, 1H), 7.47-7.55 (m, 1H), 7.37 (dd, J=9.0, 1.6 Hz, 1H), 3.84 (br s, 4H)
45	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.58 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.28-8.33 (m, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.83 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.64 (dd, J=9.1, 1.5 Hz, 1H), 7.53 (dd, J=8.0, 4.7 Hz, 1H), 6.02-6.14 (m, 1H), 5.35-5.48 (m, 2H), 4.57 (d, J=6.3 Hz, 2H)
46	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.58 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.31 (dd, J=2.6, 1.5 Hz, 2H), 7.82 (d, J=15.8 Hz, 1H), 7.73 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.52 (ddd, J=8.2, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 6.71 (br s, 1H), 3.65-3.76 (m, 2H), 2.84 (t, J=18.4 Hz, 2H), 2.62 (q, J=7.4 Hz, 2H), 1.31 (t, J=7.4 Hz, 3H)
47	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.17 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.79 (br s, 1H), 8.69 (d, J=18.1 Hz, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.26-8.31 (m, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.81 (d, J=13.2 Hz, 1H), 7.66 (d, J=21.6 Hz, 1H), 7.49-7.53 (m, 1H), 4.28-4.38 (m, 1H), 1.35 (d, J=6.3 Hz, 6H)
48	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.32 (s, 1H), 9.07-9.17 (m, 1H), 8.64-8.70 (m, 1H), 8.55-8.61 (m, 1H), 8.41-8.50 (m, 1H), 8.13 (d, J=8.5 Hz, 3H), 7.88 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.73 (d, J=9.8 Hz, 1H), 7.59-7.67 (m, 3H)
49	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.70-8.75 (m, 1H), 8.62 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.27-8.36 (m, 2H), 7.86 (d, J=12.9 Hz, 1H), 7.69 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 7.52-7.54 (m, 1H), 6.46 (s, 1H), 4.45 (d, J=5.7 Hz, 2H)
50	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.7 Hz, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.55 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.30 (ddd, J=8.3, 2.7, 1.5 Hz, 1H), 7.79-7.88 (m, 2H), 7.51 (ddd, J=8.3, 4.7, 0.7 Hz, 1H), 7.35 (dd, J=8.9, 1.5 Hz, 1H), 4.00-4.18 (m, 1H), 2.93-3.10 (m, 2H), 2.30-2.44 (m, 1H), 2.10-2.19 (m, 1H), 1.80-1.92 (m, 1H), 1.71-1.80 (m, 1H), 1.51-1.71 (m, 1H), 0.90-1.04 (m, 1H)
51	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.2 Hz, 1H), 8.58 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.27-8.34 (m, 2H), 7.83 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.71 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 7.52 (dd, J=8.2, 4.7 Hz, 1H), 6.46 (br s, 1H), 3.89-4.05 (m, 1H), 3.27-3.38 (m, 1H), 1.95-2.08 (m, 1H), 1.69 (s, 3H), 1.46-1.59 (m, 1H), 1.16-1.31 (m, 2H)
52	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.58 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.28-8.34 (m, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.83 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.69 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.49-7.57 (m, 1H), 6.48 (br s, 1H), 3.78 (q, J=6.3 Hz, 2H), 2.44-2.59 (m, 2H)
53	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.19 (br s, 1H), 8.69 (d, J=4.1 Hz, 1H), 8.56 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.25-8.31 (m, 2H), 7.81 (d, J=18.4 Hz, 1H), 7.72 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 7.51 (dd, J=8.1, 4.7 Hz, 1H), 6.41 (br s, 1H), 3.36 (dd, J=7.1, 5.4 Hz, 2H), 1.05-1.17 (m, 1H), 0.58 (d, J=26.2 Hz, 2H), 0.31 (d, J=22.4 Hz, 2H)
54	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.35 (d, J=2.7 Hz, 1H), 9.19 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.46-8.52 (m, 2H), 8.13 (br s, 1H), 7.90 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.79 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.61-7.68 (m, 1H), 3.83-3.95 (m, 2H), 1.68 (t, J=18.8 Hz, 3H)

55	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.37 (d, J=4.7 Hz, 1H), 9.20 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.78 (d, J=4.9 Hz, 2H), 8.69 (dd, J=4.6, 1.3 Hz, 1H), 8.48-8.54 (m, 2H), 8.24 (br s, 1H), 7.94 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 7.81 (d, J=11.3 Hz, 1H), 7.62-7.69 (m, 1H), 7.38 (t, J=4.9 Hz, 2H), 4.84 (d, J=5.5 Hz, 3H)
56	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.60 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.35 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.30 (ddd, J=8.3, 2.6, 1.6 Hz, 1H), 7.84 (d, J=23.0 Hz, 1H), 7.79 (d, J=12.5 Hz, 1H), 7.57 (t, J=17.7 Hz, 1H), 7.49-7.54 (m, 1H), 7.43 (d, J=7.4 Hz, 1H), 7.32-7.39 (m, 2H), 4.78 (d, J=5.4 Hz, 2H)
57	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.35 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.16 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.68 (dd, J=4.6, 1.3 Hz, 1H), 8.45-8.54 (m, 1H), 8.37-8.43 (m, 1H), 7.93 (br s, 1H), 7.86 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.77 (d, J=18.6 Hz, 1H), 7.59-7.68 (m, 1H), 3.60-3.69 (m, 2H), 2.73-2.79 (m, 2H), 2.14-2.16 (m, 3H)
58	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.70 (d, J=3.5 Hz, 1H), 8.54 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.30 (d, J=9.5 Hz, 1H), 7.96 (br s, 1H), 7.82 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.52 (dd, J=8.1, 4.5 Hz, 2H), 4.77 (br s, 2H), 3.80 (br s, 2H), 3.38 (br s, 2H), 2.87 (br s, 2H), 2.17-2.31 (m, 2H), 1.21 (br s, 1H)
59	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.35 (d, J=2.7 Hz, 1H), 9.16 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.68 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.46-8.51 (m, 1H), 8.40 (s, 1H), 7.90 (br s, 1H), 7.86 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 7.76 (dt, J=9.1, 1.0 Hz, 1H), 7.61-7.66 (m, 2H), 7.17 (t, J=1.3 Hz, 1H), 6.93 (t, J=1.0 Hz, 1H), 4.18 (t, J=6.9 Hz, 2H), 3.47 (dd, J=19.2, 5.8 Hz, 2H), 2.14 (t, J=6.9 Hz, 2H)
60	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.8, 1.5 Hz, 1H), 8.57 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.27-8.34 (m, 2H), 7.82 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.72 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.52 (ddd, J=8.2, 4.7, 0.6 Hz, 1H), 7.41 (dd, J=1.8, 0.9 Hz, 1H), 6.49 (br s, 1H), 6.36 (ddd, J=14.0, 3.2, 1.3 Hz, 2H), 4.69 (d, J=5.4 Hz, 2H)
61	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.67 (dd, J=4.6, 1.0 Hz, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.26-8.33 (m, 1H), 7.80 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.50 (dd, J=8.2, 4.7 Hz, 1H), 7.31 (dd, J=8.9, 1.3 Hz, 1H), 4.03-4.18 (m, 1H), 3.98-4.24 (m, 1H), 3.47 (br s, 3H), 2.15 (br s, 1H), 1.77 (br s, 4H), 1.47-1.69 (m, 4H), 1.21-1.36 (m, J=7.1 Hz, 3H), 1.05 (br s, 3H), 0.93 (s, 1H)
62	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.59 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.28-8.33 (m, 1H), 8.10-8.15 (m, 1H), 7.84 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.60 (dd, J=9.0, 1.6 Hz, 1H), 7.53 (ddd, J=8.4, 4.7, 0.6 Hz, 1H), 4.59 (t, J=12.1 Hz, 4H)
63	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.59 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.26-8.35 (m, 2H), 7.83 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.75 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 7.45-7.58 (m, 1H), 4.83 (dd, J=8.7, 4.9 Hz, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.48 (q, J=6.9 Hz, 6H), 2.32 (d, J=5.0 Hz, 1H)
64	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.56 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.30 (ddd, J=8.3, 2.7, 1.5 Hz, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.84 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.48-7.57 (m, 1H), 7.39 (d, J=8.7 Hz, 1H), 3.20 (s, 3H), 1.60 (s, 2H), 1.55-1.68 (m, 2H)

65	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.58 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.26-8.36 (m, 2H), 7.82 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.71 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 7.52 (ddd, J=8.3, 4.7, 0.7 Hz, 1H), 7.27 (d, J=16.9 Hz, 3H), 7.09 (dd, J=3.5, 1.1 Hz, 1H), 7.00 (dd, J=5.2, 3.5 Hz, 1H), 6.47 (br s, 1H), 4.80-4.97 (m, 2H)
66	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.19 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.61 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.55 (d, J=0.8 Hz, 2H), 8.26-8.31 (m, 1H), 7.92-7.97 (m, 1H), 7.85 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.56-7.64 (m, 1H), 7.49-7.55 (m, 1H), 7.43 (dd, J=9.0, 1.3 Hz, 1H), 7.34 (d, J=4.7 Hz, 1H), 4.84 (s, 2H), 3.68 (s, 1H), 2.80 (br s, 2H), 1.74 (br s, 2H)
67	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.2 Hz, 3H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.53 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.27-8.34 (m, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.77 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.52 (s, 2H), 3.14 (s, 3H), 2.83-2.96 (m, 1H), 0.46-0.74 (m, 4H)
68	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.57 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.28-8.33 (m, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.82 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.71 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.51 (dd, J=8.2, 4.7 Hz, 1H), 6.45 (d, J=7.6 Hz, 1H), 4.36-4.49 (m, 1H), 3.45-3.60 (m, 2H), 3.42 (s, 3H), 1.34 (d, J=6.8 Hz, 3H)
69	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.58 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.28-8.34 (m, 1H), 8.03-8.09 (m, 1H), 7.85 (dt, J=9.0, 0.9 Hz, 1H), 7.49-7.57 (m, 2H), 4.40 (br s, 4H), 2.33-2.45 (m, 2H), 1.65 (br s, 1H), 1.61-1.71 (m, 2H)
70	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.25-8.41 (m, 2H), 7.81 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.69-7.78 (m, 1H), 7.51 (ddd, J=8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 3.52 (br s, 1H), 3.14 (br s, 1H), 2.79 (br s, 2H), 1.63-1.91 (m, 2H), 1.11 (br s, 8H)
71	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.58 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.32 (dd, J=1.6, 0.9 Hz, 1H), 8.28-8.31 (m, J=5.7 Hz, 1H), 7.83 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.73 (dd, J=7.4, 1.6 Hz, 1H), 7.49-7.55 (m, 1H), 7.37-7.44 (m, J=8.0 Hz, 1H), 7.34 (d, J=7.7 Hz, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.17 (d, J=8.2 Hz, 1H), 6.55 (br s, 1H)
72	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.70 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.56 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.28-8.34 (m, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.84 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.49-7.56 (m, 1H), 7.38 (d, J=7.4 Hz, 1H), 3.53-3.96 (m, 8H), 1.70-1.79 (m, 1H), 1.03 (dd, J=4.7, 2.9 Hz, 2H), 0.82 (dd, J=7.6, 2.9 Hz, 2H)
73	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.71 (d, J=3.5 Hz, 1H), 8.59 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.28-8.34 (m, 2H), 7.83 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.72 (d, J=7.4 Hz, 1H), 7.50-7.56 (m, 1H), 6.56 (br s, 1H), 4.32-4.51 (m, 1H), 4.05-4.19 (m, 1H), 3.68-3.89 (m, 2H), 3.51-3.62 (m, 1H), 1.32-1.72 (m, 9H)
74	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.72 (dd, J=4.8, 1.5 Hz, 1H), 8.62 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.28-8.33 (m, 1H), 8.06 (t, J=1.2 Hz, 1H), 7.88 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.52-7.54 (m, 1H), 7.47 (br s, 1H), 3.71 (s, 2H), 1.70-1.87 (m, 1H), 1.41 (s, 6H)

75	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.55 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.30 (ddd, J=8.3, 2.6, 1.4 Hz, 1H), 7.83 (d, J=9.8 Hz, 2H), 7.49-7.56 (m, 1H), 7.34 (d, J=10.6 Hz, 1H), 3.53-4.15 (m, 4H), 2.44-3.03 (m, 4H)
76	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.8, 1.5 Hz, 1H), 8.58-8.62 (m, 2H), 8.43 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.36 (t, J=1.3 Hz, 1H), 8.27-8.33 (m, 1H), 7.83 (d, J=9.3 Hz, 1H), 7.78 (d, J=7.6 Hz, 1H), 7.53 (dd, J=4.7, 0.8 Hz, 1H), 7.29-7.40 (m, 1H), 4.82 (d, J=5.0 Hz, 2H), 2.59 (s, 3H),
77	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.35 (d, J=1.6 Hz, 1H), 8.73 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.40 (dt, J=8.2, 1.8 Hz, 1H), 8.16 (dd, J=8.0, 0.9 Hz, 1H), 7.65 (dd, J=7.6, 0.9 Hz, 1H), 7.56 (t, J=7.8 Hz, 1H), 7.45 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 3.78 (br s, 2H), 3.68 (br s, 2H), 2.01 (br s, 2H), 1.97 (br s, 2H)
78	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.56 (t, J=6.2 Hz, 1H), 9.32 (dd, J=2.4, 0.8 Hz, 1H), 8.77 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.51 (ddd, 1H), 8.34 (dd, J=8.0, 0.8 Hz, 1H), 8.23 (dd, J=7.6, 0.9 Hz, 1H), 7.75 (t, J=7.8 Hz, 1H), 7.63 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 4.21 (m, 2H)
79	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.33 (s, 1H), 8.74 (d, J=3.5 Hz, 1H), 8.39 (dt, J=8.0, 1.9 Hz, 1H), 8.15 (dd, J=8.0, 1.1 Hz, 1H), 7.58 (t, 1H), 7.49 (dd, 1H), 7.45 (dd, 1H), 3.17 (br s, 6H)
80	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.40 (s, 1H), 8.91 (s, 1H), 8.73-8.76 (m, 3H), 8.43 (dt, J=8.2, 1.8 Hz, 1H), 8.34 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.91 (d, J=7.1 Hz, 1H), 7.69 (t, 1H), 7.48 (m, 1H), 7.14(t, 1H)
81	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.39 (d, J=1.6 Hz, 1H), 8.73 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.43 (dt, J=8.0, 2.0 Hz, 1H), 8.23 (dd, J=8.0, 0.9 Hz, 1H), 7.64 (dd, J=7.6, 0.9 Hz, 1H), 7.57 (t, J=7.7 Hz, 1H), 7.45 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 6.27 (d, J=6.8 Hz, 1H), 4.39 (七重峰的雙重峰, J=7.6, 6.6 Hz, 1H), 1.34 (d, J=6.6 Hz, 6H)
82	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.30 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.73 (dd, J=4.9, 1.6 Hz, 1H), 8.40 (ddd, 1H), 7.87 (dd, J=8.1, 0.9 Hz, 1H), 7.71 (d, J=7.7 Hz, 1H), 7.50 (t, 1H), 7.45 (dd, 1H), 6.54 (br s, 1H), 1.57 (s, 9H)
83	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:10.24 (br s, 1H), 9.34 (d, J=1.9 Hz, 1H), 8.74 (dd, 1H), 8.71 (ddd, 1H), 8.44 (dt, J=8.3, 1.9 Hz, 1H), 8.37 (dt, J=7.8, 1.0 Hz, 1H), 8.07 (d, J=7.4 Hz, 1H), 7.95-7.99 (m, 2H), 7.59 (t, 1H), 7.56 (ddd, 1H), 7.46 (dd, J=8.0, 4.8 Hz, 1H)
84	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.39 (d, J=1.7 Hz, 1H), 8.74 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.40-8.47 (dt, 1H), 8.26 (dd, J=8.0, 0.9 Hz, 1H), 7.71 (dd, J=7.6, 0.9 Hz, 1H), 7.58-7.64 (t, 1H), 7.47 (dd, J=7.2, 5.0 Hz, 1H), 6.94 (br t, 1H), 3.75-3.82 (q, 2H), 2.80-2.88 (t, 2H), 2.18 (s, 3H)
85	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.39 (dd, J=2.2, 0.6 Hz, 1H), 8.74 (dd, J=4.9, 1.6 Hz, 1H), 8.39-8.47 (dt, 1H), 8.21-8.28 (dd, 1H), 7.69 (dd, J=7.6, 0.9 Hz, 1H), 7.60 (t, 1H), 7.46 (ddd, J=7.9, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 6.93 (br t, 1H), 3.76 (q, 2H), 2.89 (t, J=6.4 Hz, 2H), 1.34-1.41 (s, 9H)
86	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.32 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.76 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.39 (dt, 1H), 8.37 (d, 1H), 8.19 (d, 1H), 8.05 (m, 1H), 7.85 (dd, J=8.8, 2.2 Hz, 1H), 7.47 (dd, 1H), 6.79 (d, J=2.4 Hz, 1H)

87	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.34 (br s, 1H), 8.75 (br s, 1H), 8.41 (dt, J=8.0 Hz, 1H), 8.16 (d, 1H), 8.13 (t, 1H), 7.72 (dt, J=8.5, 1.6 Hz, 1H), 7.53 (td, 1H), 7.45-7.49 (m, 1H), 7.35-7.40 (m, 1H), 7.26 (m, 1H), 7.21(ddd, 1H),
88	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.33 (br s, 1H), 8.76 (br s, 1H), 8.43 (d, J=1.3 Hz, 1H), 8.37-8.42 (dt, 1H), 8.13 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.86 (dd, J=8.5, 1.9 Hz, 1H), 7.48 (dd, J=7.3, 4.2 Hz, 1H), 6.00 (br d, 1H), 4.35 (m, 1H), 1.32 (d, J=6.6 Hz, 6H)
89	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.31 (s, 1H), 8.75 (d, J=3.5 Hz, 1H), 8.40 (ddd, 1H), 8.14 (dd, 1H), 8.11 (dd, 1H), 7.69 (dd, J=8.4, 1.6 Hz, 1H), 7.47 (dd, 1H), 3.71 (t, J=7.0 Hz, 2H), 3.51 (t, J=6.6 Hz, 2H), 1.94-2.06 (m, 2H), 1.89-1.94 (m, 2H)
90	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.32 (br s, 1H), 8.77 (d, J=4.3 Hz, 1H), 8.48 (d, J=1.4 Hz, 1H), 8.40 (dt, J=7.9, 2.0 Hz, 1H), 8.16 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.90 (dd, J=8.5, 1.7 Hz, 1H), 7.48 (dd, J=7.8, 4.7 Hz, 1H), 6.48 (br t, 1H), 4.20 (qd, J=9.0 Hz, 1H)
91	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.31 (s, 1H), 8.75 (d, J=3.9 Hz, 1H), 8.39 (dt, J=8.0, 1.9 Hz, 1H), 8.11 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.99 (br s, 1H), 7.52 (d, J=7.1 Hz, 1H), 7.46 (dd, J=7.8, 4.7 Hz, 1H), 4.07 + 4.99 (二個 br s, 1H), 2.99 + 2.86 (二個 br s, 3H), 1.14-1.32 (m, 6H)
92	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.33 (br s, 1H), 8.76 (d, J=3.9 Hz, 1H), 8.47 (d, J=1.7 Hz, 1H), 8.40 (dt, J=8.2, 1.8 Hz, 1H), 8.13 (dd, J=8.5, 0.6 Hz, 1H), 7.93 (dd, J=8.6, 1.8 Hz, 1H), 7.47 (dd, J=8.0, 4.8 Hz, 1H), 6.92 (d, J=6.9 Hz, 1H), 4.68-4.77 (m, 1H), 1.54 (d, 3H), 1.54 (s, 9H)
93	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.32 (s, 1H), 8.76 (d, J=4.3 Hz, 1H), 8.43 (d, 1H), 8.40 (ddd, 1H), 8.12 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.83 (dd, J=8.5, 1.7 Hz, 1H), 7.47 (dd, J=7.7, 4.7 Hz, 1H), 6.32 (br s, 1H), 2.96 (td, J=7.1, 3.2 Hz, 1H), 0.93 (m, 2H), 0.68 (m, 2H)
94	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.32 (br s, 1H), 8.76 (d, J=4.3 Hz, 1H), 8.43 (d, 1H), 8.40 (ddd, 1H), 8.12 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.85 (dd, J=8.5, 1.7 Hz, 1H), 7.47 (dd, J=7.9, 4.7 Hz, 1H), 6.13 (d, 1H), 4.46 (m, 1H), 2.02-2.18 (m, 2H), 1.74-1.81 (m, 2H), 1.64-1.74 (m, 2H), 1.50-1.62 (m, 2H)
95	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.32 (br s, 1H), 8.75 (d, J=4.3 Hz, 1H), 8.41 (d, 1H), 8.40 (ddd, 1H), 8.12 (dd, J=8.5, 0.6 Hz, 1H), 7.82 (dd, J=8.5, 1.7 Hz, 1H), 6.06 (t, 1H), 3.03 (d, J=5.8 Hz, 2H), 0.17 (s, 9H)
96	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.32 (br. s., 1H), 8.76 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.46 (d, J=1.7 Hz, 1H), 8.39-8.42 (ddd, 1H), 8.14 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.90 (dd, J=8.5, 1.7 Hz, 1H), 7.48 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 6.72 (br t, 1H), 3.74 (q, 2H), 2.82 (t, 2H), 2.18 (s, 3H)
97	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.5-9.2 (br. s, 1H), 8.9-8.7 (br s, 1H), 8.39-8.43 (m, 2H), 8.12 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.86 (dd, J=8.5, 1.9 Hz, 1H), 7.6-7.5 (br s, 1H), 6.31 (s, 1H), 3.09 (s, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.57 (s, 6H)
98	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.30 (dd, J=2.4, 0.8 Hz, 1H), 8.76-8.82 (m, 2H), 8.70 (d, J=1.3 Hz, 1H), 8.49 (ddd, 1H), 8.17 (d, J=9.0 Hz, 1H), 8.05 (dd, J=8.5, 1.7 Hz, 1H), 7.64 (ddd, J=8.0, 4.7, 0.8 Hz, 1H), 5.02 (t, J=4.6 Hz, 1H), 3.93-3.98 (m, 2H), 3.79-3.86 (m, 2H), 3.47 (dd, J=5.8, 4.6 Hz, 2H)

99	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.31 (dd, J=2.4, 0.8 Hz, 1H), 8.79 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.70 (t, 1H), 8.67 (s, 1H), 8.50 (ddd, J=8.0, 2.3, 1.7 Hz, 1H), 8.18 (d, 1H), 7.99-8.06 (m, 2H), 7.64 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.9 Hz, 1H), 3.35 (q, J=6.4 Hz, 2H), 3.24 (q, J=6.3 Hz, 2H), 1.82 (s, 3H)
100	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.31 (dd, J=2.3, 0.9 Hz, 1H), 8.79 (dd, J=4.7, 1.6 Hz, 1H), 8.74 (dd, 1H), 8.50 (ddd, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.18 (d, 1H), 8.05 (dd, J=8.5, 1.7 Hz, 1H), 7.89 (dd, 1H), 7.65 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 4.67 (dd, J=10.1, 6.9 Hz, 1H), 3.23-3.30 (m, 1H), 3.07-3.15 (m, 1H), 1.91-1.98 (m, 2H), 1.83-1.68 (m, 2H), 1.55-1.65 (m, 1H), 1.22-1.32 (m, 1H)
101	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.32 (d, J=1.7 Hz, 1H), 8.76 (dd, J=4.7, 1.6 Hz, 1H), 8.37-8.43 (m, 2H), 8.14 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.83 (dd, J=8.5, 1.7 Hz, 1H), 7.47 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 6.13 (s, 1H), 1.76 (s, 6H)
102	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.31 (dd, J=2.4, 0.8 Hz, 1H), 8.88 (br s, 1H), 8.79 (dd, J=4.7, 1.6 Hz, 1H), 8.73 (d, J=1.4 Hz, 1H), 8.50 (dt, J=8.3, 1.8 Hz, 1H), 8.19 (d, J=8.5 Hz, 1H), 8.08 (dd, J=8.5, 1.7 Hz, 1H), 7.94 (br t, 1H), 7.64 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.9 Hz, 1H), 3.88 (br s, 2H), 3.12 (m, 2H), 1.04 (t, J=7.2 Hz, 2H)
103	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.33 (s, 1H), 8.77 (d, J=3.8 Hz, 1H), 8.41 (d, J=7.9 Hz, 1H), 8.31 (s, 1H), 8.14 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.76 (dd, J=8.5, 1.6 Hz, 1H), 7.48 (dd, J=7.6, 4.9 Hz, 1H), 4.61 (t, J=11.8 Hz, 4H)
104	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.33 (s, 1H), 8.76 (d, J=4.1 Hz, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.40 (ddd, 1H), 8.15 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.89 (dd, J=8.5, 1.7 Hz, 1H), 7.48 (dd, J=7.4, 4.9 Hz, 1H), 6.22 (d, J=9.5 Hz, 1H), 5.00 (m, 1H), 1.48 (d, J=6.9 Hz, 3H)
105	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.31 (s, 1H), 8.74 (d, J=3.3 Hz, 1H), 8.39 (dt, J=7.9, 2.0 Hz, 1H), 8.34 (d, J=1.9 Hz, 1H), 8.16 (d, J=8.8 Hz, 1H), 8.02 (d, J=2.5 Hz, 1H), 7.85 (dd, J=8.8, 2.4 Hz, 1H), 7.78 (d, J=1.4 Hz, 1H), 7.47 (dd, J=7.7, 5.4 Hz, 1H), 6.54 (dd, J=2.4, 1.8 Hz, 1H)
106	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.33 (dd, J=2.2, 0.8 Hz, 1H), 8.76 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.59-8.63 (ddd, 1H), 8.55 (d, J=1.7 Hz, 1H), 8.39-8.44 (ddd, 1H), 8.16 (d, J=8.5 Hz, 1H), 8.02 (dd, J=8.6, 1.8 Hz, 1H), 7.79 (br t, 1H), 7.73 (td, J=7.7, 1.7 Hz, 1H), 7.48 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.9 Hz, 1H), 7.37 (d, J=7.7 Hz, 1H), 4.83 (d, J=4.6 Hz, 2H)
107	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.33 (s, 1H), 8.76 (d, J=3.8 Hz, 1H), 8.38-8.43 (ddd, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.14 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.74 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.48 (dd, J=8.0, 4.8 Hz, 1H), 5.19 (br s, 1H), 3.72 (dt, J=10.8, 7.4 Hz, 1H), 3.61 (br s, 1H), 2.07-2.29 (m, 3H), 1.92 (br s, 1H)
108	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.31 及 9.35 (二個 s, 1H), 8.74 (m, 1H), 8.61 及 8.47 (二個 d, 1H), 8.39 及 8.35 (二個 d, 1H), 8.21 及 7.70 (二個 s, 1H), 8.12 及 7.87 (二個 d, 1H), 7.77 及 6.98 (二個 d, 1H), 7.67 及 7.53 (二個 t, 1H), 7.49-7.43 (m, 1H), 7.41 及 7.31 (二個 d, 1H), 7.18 及 7.10 (二個 dd, 1H), 5.40 及 5.01 (二個 m, 1H), 4.05-3.87 及 3.73-3.67 (m, 2H), 2.51-1.89 (m, 4H)



109	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.33 (dd, J=2.4, 0.8 Hz, 1H), 8.76 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.51 (d, J=1.7 Hz, 1H), 8.39-8.43 (ddd, 1H), 8.16 (dd, J=8.5, 0.6 Hz, 1H), 7.96 (dd, J=8.5, 1.9 Hz, 1H), 7.55-7.61 (t, 1H), 7.47 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.9 Hz, 1H), 7.45 (dd, J=7.8, 0.7 Hz, 1H), 7.35-7.39 (m, 2H), 4.79 (d, J=5.2 Hz, 2H)
110	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.30-9.36 (m, 1H), 8.76 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.50 (dd, J=9.9, 2.0 Hz, 2H), 8.36-8.44 (ddd, 1H), 8.15 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.97 (dd, J=8.5, 1.9 Hz, 1H), 7.71-7.81 (m, 2H), 7.47 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 5.75-5.84 (pentet, 1H), 1.52-1.60 (m, 3H)
111	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:8.88 (dd, J=2.4, 0.8 Hz, 1H), 8.35 (dd, J=4.7, 1.6 Hz, 1H), 8.32 (d, J=1.7 Hz, 1H), 8.19 (d, J=7.6 Hz, 1H), 8.07 (ddd, J=8.0, 2.4, 1.6 Hz, 1H), 7.74 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.66 (dd, J=8.7, 1.7 Hz, 1H), 7.46-7.53 (t, 1H), 7.21 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 4.04 (五重峰, J=7.3 Hz, 1H), 2.63-2.72 (m, 2H), 0.92 (d, J=7.1 Hz, 3H), 0.60 (t, J=7.2 Hz, 3H)
112	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.31 (dd, J=2.2, 0.8 Hz, 1H), 8.79 (dd, J=4.7, 1.6 Hz, 1H), 8.73-8.76 (m, 1H), 8.59 (d, J=7.6 Hz, 1H), 8.50 (ddd, J=8.0, 2.4, 1.6 Hz, 1H), 8.18 (d, J=9.0 Hz, 1H), 8.09 (dd, J=8.5, 1.7 Hz, 1H), 7.82 (d, J=7.4 Hz, 1H), 7.65 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 4.47 (五重峰, 1H), 3.79-3.90 (m, 1H), 1.34 (d, J=7.1 Hz, 3H), 1.07 (dd, J=12.8, 6.6 Hz, 6H)
113	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.33 (dd, J=2.2, 0.8 Hz, 1H), 8.78 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=1.6, 0.8 Hz, 1H), 8.47-8.53 (ddd, 1H), 8.11-8.17 (m, 2H), 8.05 (br d, J=6.8 Hz, 1H), 7.98 (br s, 1H), 7.61 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 4.75 (quin, J=7.2 Hz, 1H), 3.96-4.09 (m, 2H), 1.51 (d, J=7.1 Hz, 3H)
114	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.29-9.40 (br s, 1H), 8.75-8.81 (br s, 1H), 8.73-8.75 (dd, 1H), 8.40-8.45 (dt, 1H), 8.28 (dd, 1H), 8.19-8.24 (d, 1H), 7.46-7.53 (dd, 1H), 2.51 (s, 3H)
115	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.70-9.78 (br s, 1H), 9.19-9.26 (dd, 1H), 8.70-8.75 (dd, 1H), 8.38-8.42 (ddd, 1H), 8.35-8.38 (s, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.57-7.63 (dd, 1H), 7.49-7.56 (dd, 1H), 1.51 (s, 9H)
116	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.81 (d, J=1.7 Hz, 1H), 9.25 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 9.17 (t, J=1.2 Hz, 1H), 8.97 (ddd, J=8.0, 2.4, 1.7 Hz, 1H), 8.61 (m, 2H), 8.09 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.8 Hz, 2H), 7.73 (br s, 1H), 7.22-7.30 (br s, 1H)
117	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.71 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.58 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.28-8.33 (m, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.83 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.64 (dd, J=9.1, 1.5 Hz, 1H), 7.53 (dd, J=8.0, 4.7 Hz, 1H), 6.02-6.14 (m, 1H), 5.35-5.48 (m, 2H), 4.57 (d, J=6.3 Hz, 2H)
118	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.34 (dd, J=2.2, 0.8 Hz, 1H), 8.79 (d, J=4.9 Hz, 2H), 8.76 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.57 (dd, J=1.7 Hz, 1H), 8.40-8.44 (ddd, 1H), 8.18 (dd, J=8.5 Hz, 1H), 8.04 (dd, J=8.6, 1.8 Hz, 1H), 7.70 (br t, 1H), 7.46-7.50 (ddd, 1H), 7.29 (t, J=4.9 Hz, 1H), 4.97 (d, J=4.6 Hz, 2H)
119	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.33 (dd, J=2.3, 0.7 Hz, 1H), 8.77 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.38-8.43 (dt, 1H), 8.33 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.22 (d, J=8.8 Hz, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.84 (dd, J=8.8, 2.2 Hz, 1H), 7.46-7.51 (ddd, 1H)

120	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.34 (s, 1H), 8.77 (d, 1H), 8.40-8.45 (m, 1H), 8.35-8.49 (m, 1H), 8.25-8.31 (m, 2H), 7.97-8.03 (d, 1H), 7.91 (dd, J=8.7, 2.1 Hz, 1H), 7.54-7.62 (m, 2H), 7.45-7.51 (dd, 1H)
121	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.11 (s, 1H), 8.62 (d, J=2.8 Hz, 1H), 8.47 (d, J=1.4 Hz, 1H), 8.17 (ddd, 1H), 8.15 (d, 1H), 7.91 (dd, J=8.5, 1.7 Hz, 1H), 6.66-6.72 (br t, 1H), 3.74 (q, J=6.6 Hz, 2H), 2.79-2.85 (t, 2H), 2.18 (s, 3H)
122	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.08-9.15 (br s, 1H), 8.57-8.66 (br s, 1H), 8.46 (d, J=1.3 Hz, 1H), 8.17 (ddd, 1H), 8.14 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.91 (dd, J=8.5, 1.7 Hz, 1H), 6.62 (br m, 1H), 4.11 (qd, J=7.3, 3.3 Hz, 1H), 3.90-3.95 (dt, 1H), 3.84-3.90 (ddd, 1H), 3.78-3.84 (dt, 1H), 3.37 (ddd, J=13.7, 7.7, 4.6 Hz, 1H), 2.02-2.13 (m, 1H), 1.91-2.00 (m, 2H), 1.60-1.70 (m, 1H)
123	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.11 (s, 1H), 8.62 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.45 (d, J=1.3 Hz, 1H), 8.17 (ddd, 1H), 8.14 (d, 1H), 7.90 (dd, J=8.5, 1.7 Hz, 1H), 6.43-6.51 (br d, 1H), 4.37-4.50 (m, 1H), 3.55 (dd, J=3.9 Hz, 1H), 3.46-3.49 (dd, 1H), 3.42 (s, 3H).
124	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.11 (s, 1H), 8.62 (d, J=2.7 Hz, 1H), 8.45 (d, J=1.3 Hz, 1H), 8.15-8.18 (ddd, 1H), 8.13 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.87 (dd, J=8.5, 1.9 Hz, 1H), 6.13-6.20 (br s, 1H), 3.57 (dq, J=7.3, 5.6 Hz, 2H), 1.31 (t, J=7.3 Hz, 3H)
125	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.06-9.20 (br s, 1H), 8.55-8.70 (br s, 1H), 8.14-8.19 (m, 2H), 8.10-8.13 (d, 1H), 7.70 (dd, J=8.4, 1.7 Hz, 1H), 3.66-3.74 (t, 2H), 3.50 (t, 2H), 2.05-1.97 (m, 2H), 1.96-1.89 (m, 2H)
126	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.07-9.15 (br s, 1H), 8.59-8.66 (br s, 1H), 8.44 (d, J=1.4 Hz, 1H), 8.15-8.18 (ddd, 1H), 8.13 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.87 (dd, J=8.5, 1.9 Hz, 1H), 5.96-6.04 (br d, 1H), 4.30-4.40 (m, 1H), 1.32 (d, J=6.6 Hz, 6H).
127	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.13 (br s, 1H), 8.64 (br s, 1H), 8.49 (d, J=1.7 Hz, 1H), 8.14-8.20 (m, 2H), 7.92 (dd, J=8.5, 1.7 Hz, 1H), 6.43 (br t, J=6.6 Hz, 1H), 4.20 (qd, J=9.0, 6.5 Hz, 2H)
128	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.32 (br s, 1H), 8.75 (br s, 1H), 8.40 (dt, J=8.2, 1.8 Hz, 1H), 8.27 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.17 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.84 (d, J=3.9 Hz, 1H), 7.79 (dd, J=8.7, 2.1 Hz, 1H), 7.47 (dd, J=7.9, 4.9 Hz, 1H), 7.13-7.18 (dq, 1H), 2.31 (d, J=1.3 Hz, 3H)
129	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.49 (s, 1H), 9.19 (s, 1H), 9.13 (s, 1H), 8.80 (d, J=4.7 Hz, 2H), 8.73 (s, 1H), 8.60-8.67 (m, 1H), 8.19 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.84 (br s, 1H), 7.29-7.36 (m, J=9.6 Hz, 1H), 5.00 (d, J=4.3 Hz, 2H)
130	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.44 (s, 1H), 9.12 (d, J=0.8 Hz, 2H), 8.62 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.15 (d, J=8.8 Hz, 1H), 6.15 (br s, 1H), 4.29-4.45 (m, 1H), 1.35 (d, J=6.6 Hz, 6H)
131	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.03 (s, 1H), 8.60 (d, J=0.6 Hz, 1H), 8.56 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.13 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.79 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.73 (d, J=7.6 Hz, 1H), 6.64 (br s, 1H), 4.06-4.22 (m, 1H), 3.92 (dt, J=8.3, 6.7 Hz, 1H), 3.76-3.88 (m, 2H), 3.37 (ddd, J=13.8, 7.6, 4.6 Hz, 1H), 2.03-2.13 (m, 1H), 1.91-2.00 (m, 2H), 1.81 (br s, 1H), 1.65 (dd, J=12.2, 8.1 Hz, 1H)

132	$^1\text{H NMR (CDCl}_3\text{)}$ $\delta$ :9.03 (d, J=1.9 Hz, 1H), 8.61 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.57 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.27-8.32 (m, J=1.6, 0.9 Hz, 1H), 8.11-8.16 (m, 1H), 7.82 (d, J=9.3 Hz, 1H), 7.74 (dd, J=7.3, 1.7 Hz, 1H), 6.50 (br s, 1H), 3.92 (td, J=13.7, 6.3 Hz, 2H), 1.66-1.79 (m, 3H), 1.71 (t, J=18.6 Hz, 4H)
133	$^1\text{H NMR (CDCl}_3\text{)}$ $\delta$ :9.03 (s, 1H), 8.60 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.56 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.13 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.80 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.72 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 6.50 (t, J=5.3 Hz, 1H), 4.54 (t, J=5.2 Hz, 1H), 3.66 (t, J=5.5 Hz, 2H), 3.47 (s, 6H)
134	$^1\text{H NMR (DMSO-}d_6\text{)}$ $\delta$ :9.41 (d, J=0.8 Hz, 1H), 9.37 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.01 (s, 1H), 8.66-8.72 (m, 1H), 8.50-8.57 (m, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.85 (d, J=4.4 Hz, 2H), 7.78 (d, J=9.3 Hz, 1H), 7.65 (s, 2H), 7.21 (d, J=4.4 Hz, 1H), 4.49 (d, J=5.5 Hz, 2H)
135	$^1\text{H NMR (丙酮-}d_6\text{)}$ $\delta$ :10.24 (br s, 1H), 9.13 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.86 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.51 (br. s, 1H), 8.29-8.39 (m, 2H), 8.00 (dd, J=8.4, 1.0 Hz, 1H), 7.76 (ddd, J=8.2, 4.7, 0.8 Hz, 1H), 7.45 (t, J=7.5 Hz, 1H), 3.69 (br s, 3H)
136	$^1\text{H NMR (丙酮-}d_6\text{)}$ $\delta$ :9.25 (br s, 1H), 9.11 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.86 (d, J=5.4 Hz, 1H), 8.29-8.39 (m, 2H), 7.99 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.77 (ddd, J=8.2, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.46 (t, J=7.8 Hz, 1H), 4.36 (qd, J=9.5, 6.5 Hz, 2H)
137	$^1\text{H NMR (丙酮-}d_6\text{)}$ $\delta$ :10.06 (br s, 1H), 9.34 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.76-8.88 (m, 3H), 8.44-8.55 (m, 1H), 8.30 (dd, J=6.9, 1.1 Hz, 1H), 7.94 (dd, J=8.5, 1.1 Hz, 1H), 7.79 (ddd, J=8.2, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 7.42-7.45 (m, 1H), 7.41 (s, 1H), 4.93 (d, J=4.7 Hz, 2H)
138	$^1\text{H NMR (CDCl}_3\text{)}$ $\delta$ :10.25 (br s, 1H), 9.66 (s, 1H), 8.80-8.88 (m, 1H), 8.73 (d, J=4.9 Hz, 1H), 8.60 (dt, J=8.1, 1.9 Hz, 1H), 8.29 (dd, J=7.7, 0.9 Hz, 2H), 7.78 (dd, J=8.2, 0.9 Hz, 1H), 7.46-7.59 (m, 1H), 7.23-7.33 (m, 1H), 5.11 (d, J=4.6 Hz, 2H)
139	$^1\text{H NMR (CDCl}_3\text{)}$ $\delta$ :9.53 (dd, J=2.2, 0.6 Hz, 1H), 9.35 (br s, 1H), 8.82 (dd, J=4.9, 1.6 Hz, 1H), 8.56 (dt, J=8.0, 1.9 Hz, 1H), 8.25 (dd, J=7.8, 1.0 Hz, 1H), 7.75 (dd, J=8.1, 1.0 Hz, 1H), 7.46-7.58 (m, 2H), 4.22 (dd, J=6.8, 3.8 Hz, 1H), 4.04 (dt, J=8.2, 6.7 Hz, 1H), 3.81-3.92 (m, 2H), 3.61-3.75 (m, 1H), 2.02-2.18 (m, 1H), 1.86-2.01 (m, 3H), 1.67-1.85 (m, 2H)
140	$^1\text{H NMR (CDCl}_3\text{)}$ $\delta$ :9.51 (dd, J=2.2, 0.9 Hz, 1H), 9.44 (br s, 1H), 8.85 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.53 (d, J=7.9 Hz, 1H), 8.27 (d, J=7.8 Hz, 1H), 7.82 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.47-7.63 (m, 2H), 4.30 (qd, J=9.2, 6.2 Hz, 2H), 0.07 (s, 1H), 0.01 (s, 1H), -0.01 (s, 1H)
141	$^1\text{H NMR (CDCl}_3\text{)}$ $\delta$ :9.49 (s, 1H), 9.07 (br. s, 1H), 8.83 (d, J=5.1 Hz, 1H), 8.51 (d, J=7.9 Hz, 1H), 8.25 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.02 (s, 2H), 7.75 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.46-7.58 (m, 2H), 3.08 (dd, J=7.3, 3.7 Hz, 1H), 0.88-1.03 (m, 2H), 0.70-0.81 (m, 2H),
142	$^1\text{H NMR (CDCl}_3\text{)}$ $\delta$ :9.20 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.14 (br s, 1H), 8.73 (d, J=5.2 Hz, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.35 (d, J=7.1 Hz, 1H), 8.20 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.88 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.56 (ddd, J=8.2, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.30 (t, J=7.7 Hz, 1H), 3.08 (td, J=7.3, 3.5 Hz, 1H), 0.87-1.01 (m, 2H), 0.65-0.80 (m, 2H), 0.01 (br s, 1H), -0.01 (br s, 1H)

158	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.46 (s, 1H), 8.76 (d, J=3.9 Hz, 1H), 8.49 (dt, J=8.0, 1.9 Hz, 1H), 8.26-8.40 (m, 1H), 7.68 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.47 (dd, J=7.7, 5.0 Hz, 1H), 7.16 (dd, J=8.5, 2.0 Hz, 1H), 3.71-3.83 (m, 1H), 3.55-3.71 (m, 1H), 3.48 (t, J=6.8 Hz, 1H), 3.38 (s, 1H), 3.13-3.30 (m, 1H), 2.85 (s, 1H), 2.17-2.35 (m, 3H)
159	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.39 (d, J=1.6 Hz, 1H), 8.81 (dd, J=4.9, 1.6 Hz, 1H), 8.55-8.73 (m, 1H), 8.45 (d, J=1.7 Hz, 1H), 7.69-7.85 (m, 2H), 7.48 (dd, J=8.6, 2.0 Hz, 1H), 1.78-1.90 (m, 1H), 0.89-1.07 (m, 3H), 0.83 (dt, J=7.9, 3.3 Hz, 2H)
160	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.37 (d, J=1.7 Hz, 1H), 8.75 (d, J=5.2 Hz, 1H), 8.52 (dt, J=8.0, 1.9 Hz, 1H), 8.33 (br s, 1H), 8.22 (d, J=8.0 Hz, 1H), 8.09 (d, J=7.6 Hz, 1H), 7.66 (t, J=7.9 Hz, 1H), 7.58-7.62 (m, 1H), 4.62-4.73 (m, 1H), 2.74-2.86 (m, 1H), 2.30-2.45 (m, 2H), 2.19 (dq, J=11.9, 9.5 Hz, 2H), 1.73-1.84 (m, 2H)
161	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.36 (s, 1H), 8.75 (d, J=5.0 Hz, 1H), 8.49 (d, J=7.9 Hz, 1H), 8.20-8.22 (m, 1H), 8.20 (s, 1H), 8.11 (d, J=7.6 Hz, 1H), 7.65 (t, J=7.6 Hz, 1H), 7.58 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 4.11 (dd, J=6.8, 4.9 Hz, 1H), 3.83-3.88 (m, 1H), 3.60-3.72 (m, 2H), 3.51 (ddd, J=13.6, 6.7, 5.8 Hz, 1H), 3.33 (s, 2H), 1.99-2.07 (m, 1H), 1.83-1.96 (m, 2H), 1.66-1.73 (m, 1H)
162	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.37 (d, J=1.7 Hz, 1H), 8.76 (dd, J=4.7, 1.6 Hz, 1H), 8.52 (dt, J=8.0, 1.9 Hz, 1H), 8.25 (d, J=8.0 Hz, 1H), 8.18 (d, J=7.6 Hz, 1H), 7.69 (t, J=7.8 Hz, 1H), 7.60 (dd, J=8.0, 4.8 Hz, 1H), 3.72 (s, 3H)
163	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.37 (s, 1H), 8.76 (d, J=5.1 Hz, 1H), 8.52 (d, J=8.0 Hz, 1H), 8.22 (dd, J=8.0, 0.9 Hz, 2H), 8.01 (d, J=7.7 Hz, 1H), 7.58-7.66 (m, 2H), 3.04 (td, J=7.3, 3.9 Hz, 1H), 0.77-0.87 (m, 2H), 0.65-0.75 (m, 2H)
173	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.25 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.16 (d, J=6.6 Hz, 1H), 8.73 (dd, J=4.8, 1.3 Hz, 1H), 8.58-8.69 (m, 2H), 8.41 (ddd, J=8.3, 2.7, 1.5 Hz, 1H), 7.71 (dd, J=5.7, 3.3 Hz, 1H), 7.40-7.63 (m, 1H), 6.64 (br s, 1H), 4.22 (dd, J=8.6, 6.1 Hz, 1H), 4.12 (qd, J=7.4, 3.2 Hz, 1H), 3.78-3.97 (m, 3H), 3.38 (ddd, J=13.7, 7.8, 4.7 Hz, 1H), 1.88-2.02 (m, 2H)
200	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:11.67-12.28 (m, 1H), 9.26-9.29 (m, 1H), 8.63 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.33 (dt, J=8.0, 1.9 Hz, 1H), 7.81 (br s, 1H), 7.30-7.41 (m, 2H), 7.28 (s, 1H), 7.20 (t, J=7.7 Hz, 1H), 3.72 (d, J=6.8 Hz, 3H), 1.91-2.08 (m, 5H)
201	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) 位移:9.57 (s, J=8.6 Hz, 1H), 8.64-8.71 (m, 2H), 8.15 (s, 1H), 7.49-7.88 (m, 2H), 7.39 (t, J=6.7 Hz, 1H), 6.17 (br s, 1H), 4.24-4.40 (m, 1H), 1.26-1.32 (m, 7H)
300	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.29-9.37 (m, 1H), 8.79 (d, J=4.9 Hz, 2H), 8.62 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.47 (d, J=9.5 Hz, 1H), 7.93 (d, J=8.6 Hz, 1H), 7.81 (dd, J=6.9, 0.6 Hz, 1H), 7.48 (dd, J=8.7, 6.9 Hz, 1H), 7.31-7.43 (m, 1H), 4.87 (d, J=5.5 Hz, 2H)
301	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.61 (s, 1H), 9.36 (d, J=0.9 Hz, 1H), 9.25 (s, 1H), 8.33-8.54 (m, 1H), 7.97 (dt, J=8.8, 0.8 Hz, 1H), 7.80 (d, J=7.0 Hz, 1H), 7.47 (dd, J=7.7 Hz, 1H), 4.27 (dd, J=9.6, 6.5 Hz, 1H)

302	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.60 (s, 2H), 9.38 (s, 1H), 9.24 (s, 1H), 8.79 (d, J=4.9 Hz, 1H), 8.31 (br s, 1H), 7.95 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.82 (d, J=6.9 Hz, 1H), 7.49 (dd, J=8.6, 7.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J=4.8 Hz, 1H), 4.87 (d, J=5.5 Hz, 2H)
303	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.31 (d, J=2.7 Hz, 1H), 9.13 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.83 (s, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.26-8.46 (m, 1H), 8.09 (dd, J=6.9, 0.8 Hz, 1H), 7.99 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.38-7.59 (m, 2H),
304	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.33 (s, 1H), 9.29 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.07 (s, 1H), 8.69 (d, J=4.7 Hz, 1H), 8.35 (dd, J=8.4, 1.6 Hz, 1H), 8.05 (s, 2H), 7.94 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.71 (d, J=6.9 Hz, 1H), 7.44-7.61 (m, 2H)
305	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.27 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.08-9.14 (m, 1H), 8.68 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.21-8.38 (m, 1H), 7.97 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.45-7.59 (m, 2H), 7.40 (dd, J=8.7, 6.9 Hz, 2H), 4.85 (d, J=5.0 Hz, 3H) 2.53-2.67 (s, 3H)
306	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.08 (br s, 1H), 8.41 (br s, 1H), 7.85 (d, J=7.6 Hz, 3H), 7.58 (br s, 2H), 7.34 (br s, 1H), 6.94 (br s, 2H), 4.64 (br s, 1H), 3.56-3.74 (m, 3H), 2.25 (br s, 2H), 1.80 (br s, 2H), 1.73 (s, 1H), 1.70 (s, 1H), 1.50 (s, 1H), 1.40 (br s, 1H)
307	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.05-9.15 (m, 2H), 8.56 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.13 (dt, J=9.1, 2.3 Hz, 1H), 7.90-8.06 (m, 1H), 7.49 (d, J=6.5 Hz, 1H), 7.41 (dd, J=8.7, 6.9 Hz, 1H), 6.50 (br s, 1H), 4.21 (qd, J=9.0, 6.5 Hz, 2H)
308	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.04-9.15 (m, 2H), 8.54 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.13 (dt, J=9.1, 2.3 Hz, 1H), 7.92 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.46 (d, J=6.5 Hz, 1H), 7.38 (dd, J=8.7, 6.9 Hz, 1H), 6.69 (br s, 1H), 4.13 (qd, J=7.2, 3.2 Hz, 1H), 3.76-3.96 (m, 3H), 3.40 (ddd, J=13.8, 7.7, 4.7 Hz, 1H), 2.02-2.18 (m, 1H), 1.90-2.02 (m, 2H), 1.51-1.71 (m, 2H)
309	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.13 (s, 1H), 9.09 (s, 1H), 8.54 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.13 (dt, J=9.1, 2.3 Hz, 1H), 7.92 (ddd, J=7.2, 2.3, 0.9 Hz, 1H), 7.32-7.43 (m, 2H), 6.08 (d, J=6.5 Hz, 1H), 4.36 (dt, J=7.7, 6.6 Hz, 1H), 1.33 (d, J=6.5 Hz, 5H)
310	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.39-9.55 (m, 2H), 9.35 (d, J=18.6 Hz, 1H), 8.72-8.86 (m, 4H), 8.62 (dt, J=8.3, 1.3 Hz, 1H), 8.49 (br. s, 1H), 7.69 (ddd, J=8.4, 4.7, 0.6 Hz, 1H), 7.39 (t, J=4.9 Hz, 1H), 4.89 (d, J=5.7 Hz, 2H)
311	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.45 (s, 1H), 9.29 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.13 (s, 1H), 8.75 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.29-8.36 (m, 1H), 7.55 (ddd, J=8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 6.54 (br s, 1H), 2.87-3.06 (m, 1H), 0.96 (dd, J=7.0, 1.2 Hz, 2H), 0.73 (td, J=2.5, 1.3 Hz, 2H)
312	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.46 (s, 1H), 9.28 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.08 (s, 1H), 8.75 (d, J=5.2 Hz, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.33 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.54 (ddd, J=8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 6.79 (br s, 1H), 4.14 (dd, J=7.2, 3.2 Hz, 1H), 3.79-3.98 (m, 4H), 3.40-3.55 (m, 1H), 2.17 (s, 1H), 2.03-2.13 (m, 1H), 1.90-2.02 (m, 2H)
313	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.47 (s, 1H), 9.28 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.08 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.75 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.33 (ddd, J=8.3, 2.7, 1.5 Hz, 1H), 7.55 (ddd, J=8.4, 4.7, 0.6 Hz, 1H), 6.56 (br s, 1H), 4.56 (t, J=5.1 Hz, 1H), 3.62-3.79 (m, 2H), 3.48 (s, 6H)

314	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.46 (s, 1H), 9.29 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.09 (s, 1H), 8.75 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.52 (s, 1H), 8.30-8.37 (m, 1H), 7.54 (dd, J=8.4, 4.7 Hz, 1H), 7.26 (s, 1H), 6.45 (br s, 1H), 3.41 (d, J=7.1 Hz, 1H), 3.42 (d, J=7.3 Hz, 1H), 1.09 (s, 3H), 0.56-0.68 (m, 2H), 0.27-0.40 (m, 2H)
315	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.61 (br s, 1H), 9.38 (d, J=6.1 Hz, 1H), 9.22 (s, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.46-8.56 (m, 2H), 8.28 (br.s, 1H), 7.80-7.97 (m, 2H), 7.66 (ddd, J=8.4, 4.7, 0.6 Hz, 1H), 3.71 (s, 3H)
316	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.10 (br s, 1H), 8.40 (br s, 1H), 7.75 (br s, 2H), 7.58 (br s, 1H), 7.31 (d, J=9.3 Hz, 1H), 6.94 (br s, 1H), 1.77 (br s, 1H), 1.08 (br s, 2H), 0.84 (br s, 2H)
320	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.38 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.18 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.95-9.07 (m, 1H), 8.89 (d, J=5.1 Hz, 2H), 8.68 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.51 (d, J=8.9 Hz, 2H), 7.83 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.65 (ddd, J=8.3, 4.7, 0.7 Hz, 1H), 7.37 (t, J=4.8 Hz, 1H)
321	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.37 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.18 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.69 (dd, J=4.6, 1.3 Hz, 1H), 8.44-8.57 (m, 2H), 8.02-8.09 (m, 1H), 7.77-7.96 (m, 1H), 7.65 (dd, J=8.4, 4.7 Hz, 1H), 7.32 (d, J=0.8 Hz, 1H)
322	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.49 (d, J=2.0 Hz, 1H), 9.24 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.87 (dd, J=4.8, 1.5 Hz, 1H), 8.66-8.74 (m, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.52 (dt, J=8.0, 1.9 Hz, 1H), 8.23-8.42 (m, 1H), 8.13 (dd, J=9.2, 1.5 Hz, 1H), 7.92 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.40-7.57 (m, 2H)
323	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.35 (d, J=2.7 Hz, 1H), 9.15 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.68 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.49 (ddd, J=8.4, 2.7, 1.4 Hz, 1H), 8.40-8.46 (m, 1H), 7.88 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 2H), 7.76 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.64 (ddd, J=8.3, 4.7, 0.7 Hz, 1H), 3.72 (t, J=5.6 Hz, 2H), 3.55 (q, J=5.7 Hz, 2H)
324	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.10 (s, 1H), 8.45 (s, 2H), 8.09-8.15 (m, 3H), 7.75-7.85 (m, 3H), 7.62 (t, J=7.7 Hz, 3H), 7.49 (t, J=7.5 Hz, 2H)
325	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.22 (s, 1H), 8.93 (dd, J=7.1 Hz, 1H), 8.69 (d, J=5.1 Hz, 1H), 8.62 (d, J=5.2 Hz, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.32 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.89-7.97 (m, 3H), 7.60 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.52 (ddd, J=8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.40 (ddd, J=7.9, 4.8, 0.9 Hz, 1H)
326	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.37 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.19 (s, 1H), 8.77 (dd, J=1.7, 0.9 Hz, 1H), 8.69 (d, J=5.1 Hz, 1H), 8.63 (d, J=5.0 Hz, 1H), 8.51 (d, J=8.2 Hz, 1H), 8.21 (dd, J=5.0 Hz, 1H), 7.87 (dt, J=9.3, 0.9 Hz, 1H), 7.75 (d, J=5.5 Hz, 1H), 7.65 (ddd, J=8.3, 4.7, 0.7 Hz, 1H), 2.65 (s, 3H)
327	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.37 (d, J=6.3 Hz, 1H), 9.21 (s, 1H), 8.78-8.85 (m, 1H), 8.69 (dd, J=7.5 Hz, 1H), 8.51 (d, J=8.2 Hz, 1H), 8.18 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.82-7.92 (m, 2H), 7.65 (dd, J=8.2, 4.7 Hz, 1H), 4.16-4.28 (m, 2H), 4.12 (s, 2H), 1.22-1.31 (m, 3H)
328	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.36 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.19 (s, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.50 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.11-8.19 (m, 1H), 7.88 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.79 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.64 (t, J=6.8 Hz, 1H), 4.18 (d, J=6.0 Hz, 2H), 3.70-3.74 (m, 3H)

340	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.38 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.25 (s, 1H), 9.00 (s, 1H), 8.65-8.84 (m, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.38-8.56 (m, 1H), 8.05 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.94 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.67 (dd, J=8.3, 4.7 Hz, 1H)
341	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.37 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.19 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.76 (dd, J=1.7, 0.9 Hz, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.62 (d, J=5.4 Hz, 1H), 8.51 (ddd, J=8.3, 2.7, 1.5 Hz, 1H), 8.19 (dd, J=9.2, 1.7 Hz, 1H), 7.86 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.77 (d, J=5.4 Hz, 1H), 7.64 (ddd, J=8.3, 4.7, 0.7 Hz, 1H), 4.14-4.26 (m, 1H), 4.20 (d, J=7.1 Hz, 2H), 4.10 (s, 2H), 1.20-1.27 (m, 3H)
342	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.36 (d, J=2.7 Hz, 1H), 9.20 (s, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.43-8.59 (m, 2H), 7.86 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.80 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.58-7.72 (m, 1H) 2.01-2.09 (m, 10H)
347	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.38 (br s, 2H), 9.17 (br s, 1H), 8.70 (br s, 1H), 8.54 (d, J=8.0 Hz, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.94 (dd, J=9.1, 1.4 Hz, 2H), 7.76-7.90 (m, 2H), 7.61-7.76 (m, 3H), 6.97-7.16 (m, 2H), 6.75-6.97 (m, 3H), 4.32 (qd, J=7.0, 4.5 Hz, 1H), 3.98-4.19 (m, 2H), 3.70-3.91 (m, 2H), 1.82-2.00 (m, 3H), 1.73 (ddt, 3H)
348	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.22 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.97 (s, 1H), 8.70 (d, J=3.8 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.48 (s, 1H), 8.23-8.41 (m, 1H), 7.96-8.12 (m, 2H), 7.85-7.96 (m, 2H), 7.52 (dd, J=8.2, 4.7 Hz, 1H), 7.26 (s, 1H)
349	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.34 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.13 (d, J=6.9 Hz, 1H), 8.64 (d, J=5.3 Hz, 1H), 8.46-8.55 (m, 1H), 8.17 (d, J=6.6 Hz, 1H), 7.72 (dd, J=8.7, 1.0 Hz, 1H), 7.60-7.67 (m, 2H), 1.60 (s, 3H)
355	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.59 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.30 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.80-7.91 (m, 1H), 7.76 (dd, J=8.8 Hz, 1H), 7.52 (ddd, J=8.2, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.11 (br. s, 1H), 4.43-4.50 (m, 2H), 4.23-4.35 (m, 2H), 3.41 (t, J=8.4 Hz, 2H)
356	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.47 (br s, 1H), 9.35 (d, J=2.7 Hz, 1H), 8.97 (s, 1H), 8.65 (d, J=5.0 Hz, 1H), 8.41-8.54 (m, 2H), 7.78 (s, 1H), 7.72 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.59-7.67 (m, 2H), 7.24 (d, J=3.5 Hz, 1H), 6.67 (dd, J=2.1 Hz, 1H)
357	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.43 (br s, 1H), 9.32 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.93 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.64 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.45 (ddd, J=8.4, 2.7, 1.4 Hz, 1H), 8.34 (d, J=1.3 Hz, 1H), 7.67 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.59-7.63 (m, 1H), 7.49 (d, J=7.4 Hz, 2H), 7.29-7.39 (m, 3H), 7.06-7.28 (m, 1H), 3.88 (s, 2H)
358	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.44 (br s, 1H), 9.32 (d, J=2.7 Hz, 1H), 8.89 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.63 (dd, J=4.6, 1.4 Hz, 1H), 8.44 (d, J=8.2 Hz, 1H), 8.37 (s, 1H), 7.66 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.58-7.62 (m, 1H), 7.38 (dd, J=9.3, 1.9 Hz, 1H), 1.79 (tt, J=7.9, 4.6 Hz, 1H), 0.86-0.99 (m, 2H), 0.73-0.86 (m, 2H)
359	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.14-9.21 (m, 1H), 9.15 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.64 (dd, J=4.7, 1.6 Hz, 1H), 8.30-8.45 (m, 1H), 8.18-8.28 (m, 1H), 7.66 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.32-7.50 (m, 6H), 7.17-7.23 (m, 1H), 6.90-7.02 (m, 1H), 3.78 (s, 2H)

360	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.33 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.11 (br s, 1H), 8.91 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.63 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.41-8.53 (m, 1H), 7.59-7.77 (m, 2H), 7.37 (dd, J=8.6 Hz, 1H), 2.44 (dd, J=14.1, 6.9 Hz, 1H), 1.75 (dt, J=13.4, 7.8 Hz, 1H), 1.47 (ddd, J=13.4, 7.4, 6.0 Hz, 1H), 1.18 (d, J=6.8 Hz, 2H), 0.94 (t, J=7.4 Hz, 2H)
361	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.13 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.71-8.91 (m, 2H), 8.61 (s, 1H), 8.55 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 7.85 (s, 2H), 4.96 (d, J=4.6 Hz, 2H)
362	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.13 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.71-8.91 (m, 2H), 8.61 (s, 1H), 8.55 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.41 (s, 1H), 7.85 (s, 2H), 4.96 (d, J=4.6 Hz, 2H)
363	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.69 (d, J=3.8 Hz, 1H), 8.55 (s, 1H), 8.30 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.78-7.94 (m, 2H), 7.52 (dd, J=8.1, 4.8 Hz, 1H), 7.37 (d, J=8.4 Hz, 1H), 3.95-4.49 (m, 2H), 3.41-3.93 (m, 1H), 1.67-1.97 (m, 6H), 1.11 (br s, 3H)
364	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:8.74-8.82 (m, 2H), 8.62 (s, 1H), 8.35-8.48 (m, 1H), 7.83-7.94 (m, 2H), 7.59-7.67 (m, 1H), 7.25-7.29 (m, 3H), 4.96 (d, J=4.4 Hz, 2H), 4.00 (s, 2H)
365	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.24-9.27 (m, 2H), 8.63 (s, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.38 (d, J=10.0 Hz, 1H), 8.07-8.18 (m, 1H), 7.89 (dd, J=5.0 Hz, 1H), 7.79 (d, J=9.0 Hz, 1H), 5.02 (d, J=8.5 Hz, 1H), 1.48 (d, J=7.1 Hz, 3H)
366	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.26 (br s, 1H), 9.21 (s, 1H), 8.62 (br s, 1H), 8.34-8.44 (m, 2H), 7.88 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.66-7.81 (m, 2H), 3.56-3.77 (m, 1H), 2.82 (d, J=16.7 Hz, 1H), 1.33 (d, J=6.5 Hz, 3H), 1.05 (d, J=6.1 Hz, 1H), 0.51 (br s, 1H), 0.37-0.48 (m, 2H), 0.28 (br s, 1H)
367	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.25 (s, 1H), 9.20 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.39 (s, J=7.1, 7.1 Hz, 2H), 7.85 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.75 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.49-7.60 (m, 1H), 4.38-4.51 (m, 1H), 3.48-3.62 (m, 4H), 3.34 (s, 6H),
368	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.26 (s, 2H), 8.63 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.38 (d, J=9.4 Hz, 1H), 8.01 (d, J=9.6 Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.79 (d, J=8.9 Hz, 1H), 4.82 (ddd, J=9.8, 8.9, 6.5 Hz, 1H), 2.25-2.36 (m, 1H), 1.12 (d, J=6.6 Hz, 6H),
369	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.28 (s, 1H), 9.25 (d, J=9.5 Hz, 1H), 8.63 (d, J=2.8 Hz, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.39 (d, J=9.5 Hz, 1H), 8.11-8.19 (m, 1H), 7.89 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.79 (d, J=9.0 Hz, 1H), 4.15-4.20 (m, 4H), 2.79-2.84 (m, 1H), 1.26 (t, J=7.1 Hz, 3H)
370	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.26 (s, 1H), 9.21 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.32-8.43 (m, 2H), 7.87 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.75 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.49-7.59 (m, 1H), 4.29-4.44 (m, 1H), 3.52 (dd, J=9.3, 5.7 Hz, 1H), 3.40 (dd, J=9.5, 5.8 Hz, 1H), 3.34 (s, 3H), 1.26 (d, J=6.8 Hz, 3H)
371	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.35 (s, 1H), 9.17 (s, 1H), 8.68 (d, J=5.0 Hz, 1H), 8.49 (d, J=8.2 Hz, 1H), 8.40 (s, 1H), 7.99 (br s, 1H), 7.86 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.77 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.64 (ddd, J=8.3, 4.7, 0.7 Hz, 1H), 3.54-3.62 (m, 2H), 2.78-2.86 (m, 3H), 1.31-1.38 (m, 9H),



372	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.35 (dd, J=2.9, 0.7 Hz, 1H), 9.14 (d, J=1.0 Hz, 1H), 8.68 (dd, J=4.7, 1.5 Hz, 1H), 8.49 (ddd, J=8.3, 2.9, 1.6 Hz, 1H), 8.37-8.40 (m, 1H), 7.86 (dd, J=9.1, 1.8 Hz, 1H), 7.75 (dt, J=9.1, 1.3 Hz, 1H), 7.64 (ddd, J=8.4, 4.7, 0.9 Hz, 1H), 7.48 (d, J=7.0 Hz, 1H), 4.05-4.15 (m, 1H), 1.55-1.70 (m, 2H), 1.24 (d, J=6.6 Hz, 3H), 0.97 (t, J=7.4 Hz, 3H)
373	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.78 (br s, 1H), 9.37 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.22 (s, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.2 Hz, 1H), 8.43-8.61 (m, 2H), 7.86-7.99 (m, 2H), 7.74-7.85 (m, 2H), 7.65 (dd, J=8.3, 4.7 Hz, 1H), 7.21 (t, J=4.2 Hz, 1H)
374	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.04 (s, 1H), 8.87 (s, 1H), 8.73 (s, 1H), 8.35 (d, J=4.9 Hz, 2H), 8.29 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.08-8.20 (m, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.40-7.50 (m, 1H), 7.37 (d, J=9.3 Hz, 1H), 6.97 (t, J=4.8 Hz, 1H), 4.26 (d, J=5.8 Hz, 2H)
375	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.28 (s, 2H), 8.64 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.40 (d, J=9.8 Hz, 2H), 7.86 (d, J=1.4 Hz, 1H), 7.78-7.84 (m, 1H), 3.70 (s, 3H)
376	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.37 (d, J=2.5 Hz, 2H), 9.20 (s, 2H), 8.85 (br. s, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.40-8.58 (m, 3H), 7.87 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.79 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.65 (dd, J=8.2, 4.9 Hz, 1H), 1.29 (s, 10H)
377	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.68 (br. s, 1H), 9.37 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.23 (s, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.44-8.61 (m, 2H), 7.86-8.07 (m, 1H), 7.74-7.86 (m, 2H), 7.65 (dd, J=8.4, 4.3 Hz, 1H), 7.23 (d, J=3.3 Hz, 1H), 6.66 (dd, J=3.3, 1.6 Hz, 1H)
378	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.74 (br. s, 1H), 9.38 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.23 (s, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.45-8.61 (m, 2H), 8.02 (d, J=7.3 Hz, 2H), 7.92 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.83 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.57-7.73 (m, 2H), 7.53 (t, J=7.2 Hz, 2H)
379	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.36 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.17 (s, 1H), 8.96-9.03 (m, 1H), 8.68 (dd, J=4.6, 1.4 Hz, 1H), 8.45-8.59 (m, 1H), 8.36-8.43 (m, 1H), 7.85 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.78 (d, J=9.3 Hz, 1H), 7.65 (dd, J=8.3, 4.5 Hz, 1H)
380	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.55 (s, J=8.1 Hz, 2H), 9.34 (d, J=0.9 Hz, 1H), 9.26 (s, 1H), 8.60-8.66 (m, 1H), 7.94 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.74-7.88 (m, 1H), 3.93 (s, 3H)
381	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.36 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.19 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.38-8.57 (m, 2H), 8.02 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.87 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.79 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.65 (ddd, J=8.3, 4.7, 0.7 Hz, 1H), 5.00 (ddd, J=12.9, 8.2, 7.0 Hz, 1H), 3.56 (ddd, J=12.0, 11.2, 5.4 Hz, 1H), 3.39 (ddd, J=11.2, 7.0, 1.0 Hz, 1H), 2.73 (dddd, J=12.3, 6.9, 5.4, 1.4 Hz, 1H), 2.29-2.48 (m, 1H)
382	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:8.97-9.11 (m, 1H), 8.52-8.63 (m, 2H), 8.13 (dt, J=9.0, 2.4 Hz, 1H), 8.00-8.09 (m, 1H), 7.78 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.63 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.26 (s, 2H), 4.38 (br s, 2H), 4.28 (br s, 2H), 2.39 (t, J=7.7 Hz, 2H)
383	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.49 (s, 1H), 9.31 (s, 2H), 8.73 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.46-8.62 (m, 2H), 7.91 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.82 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.42-7.59 (m, 2H), 7.10-7.18 (m, 2H), 4.74 (d, J=3.6 Hz, 2H)

384	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.24-9.29 (m, 1H), 9.22 (d, J=1.0 Hz, 1H), 8.62 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.38 (d, J=9.8 Hz, 2H), 7.93-8.05 (m, 1H), 7.85-7.93 (m, 1H), 7.76 (d, J=9.1 Hz, 1H), 3.39-3.59 (m, 4H), 3.22-3.34 (m, 1H), 3.07-3.15 (m, 1H), 2.51-2.66 (m, 1H), 1.66-1.82 (m, 1H), 1.43 (s, 8H)
385	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.60 (br s, 1H), 9.36 (d, J=2.4 Hz, 1H), 9.21 (d, J=15.9 Hz, 1H), 8.69 (dd, J=4.8 Hz, 1H), 8.49-8.52 (m, 1H), 8.46 (s, 1H), 7.86 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.80 (dt, J=8.9 Hz, 1H), 7.65 (ddd, J=8.4, 4.7, 0.8 Hz, 1H), 5.49 (d, J=4.4 Hz, 1H), 3.59-3.75 (m, 2H),
386	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.36-9.38 (m, 2H), 9.28 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.29 (s, 1H), 7.82 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.75 (d, J=9.2 Hz, 1H), 6.65 (br s, 1H), 4.12 (dd, J=7.3, 3.1 Hz, 1H), 3.78-3.95 (m, 3H), 3.37 (ddd, J=13.7, 7.7, 4.7 Hz, 1H), 2.02-2.21 (m, 2H), 1.88-2.02 (m, 2H), 1.65 (dd, J=12.2, 8.1 Hz, 1H)
387	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.35-9.39 (m, 2H), 9.27-9.33 (m, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.23-8.43 (m, 1H), 7.87 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.74 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 6.40 (br s, 1H), 4.19 (qd, J=9.0, 6.5 Hz, 2H)
388	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.37 (s, 2H), 9.29 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.82 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.68 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 6.30 (br s, 1H), 2.96 (dd, J=7.0, 3.9 Hz, 1H), 0.80-1.01 (m, 3H), 0.62-0.79 (m, 2H)
389	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.08 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.80 (dt, J=10.2 Hz, 1H), 7.73 (dd, J=8.9 Hz, 1H), 6.61 (br s, 1H), 4.03-4.19 (m, 2H), 3.78-3.95 (m, 3H), 3.37 (ddd, J=13.8, 7.6, 4.7 Hz, 1H), 2.02-2.13 (m, 2H), 1.83-2.02 (m, 3H),
390	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.32 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.21 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.67 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.59 (t, J=2.2 Hz, 1H), 8.33-8.41 (m, 1H), 7.85 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.60-7.79 (m, 2H), 2.72-2.85 (m, 10H), 2.13-2.20 (m, 1H), 0.70-0.81 (m, 2H), 0.49-0.69 (m, 2H)
391	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.08 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.59-8.75 (m, 2H), 8.48-8.59 (m, 1H), 8.38 (t, J=2.2 Hz, 1H), 7.97 (dd, J=9.2, 1.5 Hz, 1H), 7.79 (d, J=9.1 Hz, 1H), 3.97 (s, 2H)
392	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.19 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.55-8.74 (m, 1H), 8.43 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.17-8.32 (m, 1H), 7.77 (d, J=9.3 Hz, 1H), 7.50 (dd, J=8.2, 4.7 Hz, 1H), 7.40 (br s, 1H), 7.13 (d, J=9.0 Hz, 1H), 3.30 (q, J=10.5 Hz, 2H)
393	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.62-8.79 (m, 1H), 8.47-8.62 (m, 1H), 8.30 (ddd, J=8.3, 2.6, 1.6 Hz, 1H), 7.90 (br s, 1H), 7.81 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.52 (dd, J=8.3, 4.8 Hz, 1H), 7.43 (br s, 1H), 0.98-1.17 (m, 1H), 0.42-0.63 (m, 2H), 0.19 (br s, 2H)
394	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (br s, 1H), 8.70 (d, J=3.9 Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.24-8.36 (m, 2H), 7.81 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.69 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.53 (dd, J=8.0, 4.7 Hz, 1H), 6.28 (br s, 1H), 2.42 (s, 1H), 1.81 (s, 6H)
395	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.67-8.85 (m, 2H), 8.57 (s, 1H), 8.22-8.44 (m, 2H), 7.76-7.93 (m, J=9.1 Hz, 1H), 7.61-7.75 (m, J=9.0 Hz, 1H), 7.52 (dd, J=8.1, 4.7 Hz, 2H), 6.27 (d, J=6.6 Hz, 2H), 4.60-4.72 (m, 1H), 2.43-2.55 (m, 2H), 1.91-2.08 (m, 2H), 1.68-1.90 (m, 2H)

396	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.12 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.74 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.46-8.64 (m, 2H), 8.27 (s, 1H), 7.80 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.73 (d, J=8.9 Hz, 1H), 6.56 (br s, 1H), 4.11 (dd, J=7.2, 3.1 Hz, 1H), 3.77-3.98 (m, 3H), 3.37 (ddd, J=13.8, 7.6, 4.6 Hz, 1H), 2.01-2.21 (m, 1H), 1.89-2.01 (m, 2H), 1.60-1.78 (m, 1H)
397	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.37 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.32 (s, 1H), 8.75-8.83 (m, 2H), 8.56-8.65 (m, 1H), 7.93 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.81 (d, J=9.0 Hz, 1H), 3.92 (s, 3H)
398	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.12 (d, J=1.9 Hz, 1H), 8.76 (d, J=1.6 Hz, 1H), 8.61 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.53 (t, J=2.2 Hz, 1H), 8.31 (dd, J=1.6, 0.9 Hz, 1H), 7.80-7.93 (m, 1H), 7.72 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 4.19 (dd, J=9.1, 6.4 Hz, 2H)
399	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.11 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.74 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.46-8.61 (m, 2H), 8.12-8.31 (m, 1H), 7.79 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.66 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 6.26 (br.S, 1H), 2.95 (d, J=3.2 Hz, 1H), 0.91 (d, J=5.7 Hz, 2H), 0.61-0.77 (m, 2H)
400	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.92-10.04 (m, 1H), 9.81-9.92 (m, 1H), 9.37 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.20-9.26 (m, 1H), 9.03-9.20 (m, 1H), 8.78 (dd, J=4.8, 1.5 Hz, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.45-8.62 (m, 2H), 8.32 (d, J=7.9 Hz, 1H), 7.87-7.99 (m, 1H), 7.83 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.61-7.74 (m, 1H), 7.55 (s, 1H)
401	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.25 (s, 1H), 9.23-9.28 (m, 1H), 9.21-9.32 (m, 1H), 8.63 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.48 (dd, J=1.6, 0.9 Hz, 1H), 8.31-8.44 (m, 1H), 7.90 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 7.80 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 4.23 (q, J=9.5 Hz, 1H), 4.22 (q, J=9.5 Hz, 2H)
402	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.37 (br s, 1H), 9.18 (s, 1H), 8.61-8.83 (m, 1H), 8.51 (d, J=7.7 Hz, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.35 (br s, 1H), 7.87 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.77 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.66 (t, J=7.1 Hz, 1H), 3.65 (s, 3H) 1.45-1.59 (m, 2H), 1.19-1.35 (m, 2H)
403	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.58 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.29-8.32 (m, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.83 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.72 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.52 (ddd, J=8.4, 4.7, 0.6 Hz, 1H), 6.36-6.45 (m, 1H), 4.18-4.31 (m, 1H), 3.55 (dd, J=9.9, 3.5 Hz, 2H), 3.41 (s, 3H), 1.65-1.81 (m, 2H), 1.02 (t, J=7.5 Hz, 3H)
404	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.51-8.64 (m, 1H), 8.28-8.36 (m, 2H), 7.84 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.71 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 7.52 (dd, J=8.3, 4.8 Hz, 1H), 6.31 (br s, 1H), 4.31 (dd, J=5.1, 2.6 Hz, 2H)
405	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:8.74 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.60 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.40 (d, J=2.7 Hz, 1H), 8.31 (dd, J=1.6, 0.9 Hz, 1H), 7.81-7.92 (m, 2H), 7.72 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 4.19 (dd, J=9.1, 6.4 Hz, 2H), 4.00 (s, 3H)
406	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:8.74 (s, 1H), 8.57 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.38 (d, J=2.8 Hz, 1H), 8.27 (s, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.80 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.73 (d, J=9.0 Hz, 1H), 6.66 (br s, 1H), 4.05-4.19 (m, 1H), 3.91-4.00 (m, 4H), 3.78-3.87 (m, 2H), 3.38 (ddd, J=13.8, 7.6, 4.8 Hz, 1H), 2.01-2.12 (m, 2H), 1.89-2.01 (m, 2H), 1.65 (dd, J=12.2, 8.3 Hz, 1H)

407	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 8.74 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.57 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.39 (d, J=2.7 Hz, 1H), 8.24 (d, J=0.9 Hz, 1H), 7.87 (t, J=2.4 Hz, 1H), 7.80 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.66 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 6.28 (br s, 1H), 3.99 (s, 3H), 2.95 (dd, J=6.9, 3.8 Hz, 1H), 0.91 (d, J=5.7 Hz, 2H), 0.56-0.75 (m, 2H)
408	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 8.75 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.40 (d, J=2.7 Hz, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.79-7.98 (m, 2H), 7.72 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 4.00 (s, 3H), 3.83 (s, 3H)
409	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9.38 (s, 2H), 9.30 (s, 1H), 8.78 (d, J=4.9 Hz, 2H), 8.64 (s, 1H), 8.43 (s, 2H), 7.87 (d, J=1.1 Hz, 2H), 7.64 (br. S, 1H), 4.97 (d, J=4.4 Hz, 2H)
410	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ: 9.26 (s, 1H), 9.21 (s, 1H), 8.62 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.34-8.42 (m, 2H), 7.85 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 2H), 7.74 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 2H), 2.89-3.06 (m, 1H), 0.70-0.81 (m, 2H), 0.58-0.69 (m, 2H)
411	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9.20 (br s, 1H), 8.71 (d, J=4.3 Hz, 1H), 8.58 (s, 1H), 8.25-8.35 (m, 2H), 7.84 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.71 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 7.53 (dd, J=8.2, 4.7 Hz, 1H), 7.27 (s, 1H), 6.25 (d, J=9.5 Hz, 1H), 4.92-5.08 (m, 1H), 1.47 (d, J=7.1 Hz, 3H)
412	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9.21 (br s, 1H), 8.72 (d, J=3.8 Hz, 1H), 8.62 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.26-8.36 (m, 2H), 7.87 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.72 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H), 7.53 (dd, J=8.2, 4.7 Hz, 1H), 6.22 (s, 1H), 4.84 (ddd, J=10.2, 8.5, 4.7 Hz, 1H) 1.10 (dd, J=9.3, 7.1 Hz, 6H)
413	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9.20 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.68 (d, J=5.1 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.30 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.78-7.82 (m, 2H), 7.51 (ddd, J=8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 7.35 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.28 (s, 1H), 3.48 (q, J=7.1 Hz, 5H), 1.21-1.36 (m, 5H)
414	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9.19 (s, 1H), 9.20 (d, J=5.2 Hz, 1H), 8.69 (dt, J=4.7, 1.7 Hz, 1H), 8.56 (dd, J=6.9, 0.8 Hz, 1H), 8.24-8.34 (m, 2H), 7.77-7.89 (m, 1H), 7.62-7.77 (m, 1H), 7.46-7.58 (m, 1H), 7.41-7.43 (m, 1H), 7.40 (d, J=7.8 Hz, 1H), 7.33 (d, J=7.7 Hz, 1H), 6.87-6.96 (m, 2H), 6.52 (d, J=7.7 Hz, 1H), 5.17 (d, J=7.7 Hz, 1H), 3.80 (s, 3H), 3.48 (q, J=7.1 Hz, 1H), 1.24-1.47 (m, 2H), 0.67 (d, J=8.7 Hz, 2H)
415	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9.20 (d, J=2.5 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.57 (d, J=0.8 Hz, 1H), 8.25-8.33 (m, 2H), 7.82 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.71 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.52 (dd, J=8.2, 4.7 Hz, 1H), 6.16 (d, J=7.6 Hz, 1H), 3.60-3.72 (m, 1H), 1.35 (d, J=6.6 Hz, 3H), 0.87-1.05 (m, 1H), 0.42-0.62 (m, 3H), 0.34 (dt, J=9.8, 4.7 Hz, 1H)
416	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ: 9.37 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.18-9.31 (m, 1H), 8.69 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.36-8.56 (m, 3H), 7.88 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.80 (d, J=9.1 Hz, 1H), 7.65 (ddd, J=8.4, 4.7, 0.6 Hz, 2H), 4.63 (d, J=6.6 Hz, 1H), 1.19 (d, J=6.6 Hz, 6H)
420	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ: 9.21 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.70 (d, J=5.1 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.25-8.35 (m, 2H), 7.84 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.72 (d, J=8.9 Hz, 1H), 7.52 (ddd, J=8.3, 4.8, 0.6 Hz, 1H), 6.64 (br s, 1H), 4.15-4.27 (m, 1H), 4.05 (ddd, J=14.2, 6.8, 3.5 Hz, 1H), 3.52-3.66 (m, 3H), 2.02-2.17 (m, 2H), 1.87-2.02 (m, 2H)

421	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:8.88 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.50-8.59 (m, 2H), 8.23-8.33 (m, 1H), 8.17 (t, J=2.2 Hz, 1H), 7.81 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.73 (dd, J=9.1, 1.7 Hz, 1H) 6.59 (br s, 1H), 4.03-4.19 (m, 1H), 3.77-3.95 (m, 3H), 3.38 (ddd, J=13.7, 7.6, 4.7 Hz, 1H), 2.62 (s, 3H), 2.01-2.17 (m, 1H), 1.89-2.01 (m, 2H), 1.56-1.74 (m, 3H)
422	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.22 (s, 1H), 8.71 (d, J=5.2 Hz, 1H), 8.55-8.64 (m, 3H), 8.32 (ddd, J=8.3, 2.7, 1.5 Hz, 1H), 8.03 (d, J=9.0 Hz, 1H), 7.90 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.45-7.57 (m, 2H), 4.09 (q, J=9.9 Hz, 2H)
423	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.23 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.98 (d, J=5.2 Hz, 2H), 8.62-8.75 (m, 1H), 8.56 (d, J=8.0 Hz, 2H), 8.44 (d, J=6.9 Hz, 1H), 8.26-8.38 (m, 1H), 8.16 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.84-8.01 (m, 3H), 7.51 (dd, J=8.2, 4.7 Hz, 1H), 7.35 (t, J=4.8 Hz, 1H)
424	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.19-9.27 (m, 8H), 8.90-9.09 (m, 5H), 8.72 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 5H), 8.64 (d, J=6.4 Hz, 4H), 8.49-8.58 (m, 4H), 8.33 (ddd, J=8.2, 2.6, 1.4 Hz, 6H), 8.10 (dd, J=9.2, 1.7 Hz, 5H), 7.96 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 5H), 7.54 (ddd, J=8.2, 4.8, 0.7 Hz, 5H)
428	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.36 (d, J=2.7 Hz, 1H), 9.10 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.70 (dd, J=4.7, 1.3 Hz, 1H), 8.42-8.56 (m, 2H), 8.38 (d, J=1.3 Hz, 1H), 7.90 (dd, J=8.8, 0.9 Hz, 1H), 7.63-7.71 (m, 2H), 5.63 (s, 1H), 4.25 (qd, J=9.6, 6.5 Hz, 2H)
429	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.34 (d, J=2.5 Hz, 1H), 9.03 (s, 1H), 8.68 (d, J=5.3 Hz, 1H), 8.48 (ddd, J=8.4, 2.7, 1.4 Hz, 1H), 8.24 (d, J=1.1 Hz, 1H), 7.83 (dd, J=8.8, 0.9 Hz, 2H), 7.58-7.65 (m, 2H), 2.99 (d, J=3.9 Hz, 1H), 0.72-0.93 (m, 3H), 0.53-0.72 (m, 2H)
430	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.22 (s, 1H), 8.77 (d, J=5.1 Hz, 2H), 8.70 (d, J=4.6 Hz, 1H), 8.52 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.31 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.82 (dd, J=17.3 Hz, 1H), 7.73-7.76 (m, 1H), 7.70 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.52 (ddd, J=8.3, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 7.22-7.32 (m, 1H), 4.97 (d, J=4.4 Hz, 2H)
431	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.21 (d, J=2.2 Hz, 1H), 8.71 (dd, J=7.1 Hz, 1H), 8.52 (d, J=0.9 Hz, 1H), 8.12-8.34 (m, 2H), 7.82 (d, J=8.7 Hz, 2H), 7.49-7.61 (m, 2H), 3.83 (s, 3H)
432	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.35 (s, 1H), 9.05 (s, 1H), 8.68 (d, J=4.9 Hz, 1H), 8.49 (d, J=8.3 Hz, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.02 (br s, 1H), 7.85 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.59-7.69 (m, 2H), 3.62-3.69 (m, 2H), 2.74-2.83 (m, 3H), 2.16 (s, 3H)
433	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.36 (s, 1H), 9.06 (s, 1H), 8.68 (d, J=5.1 Hz, 1H), 8.49 (d, J=8.2 Hz, 1H), 8.31 (s, 1H), 7.85 (dd, J=8.7, 0.9 Hz, 2H), 7.62-7.67 (m, 2H), 4.61 (t, J=5.5 Hz, 1H), 3.55 (t, J=5.8 Hz, 2H), 3.38-3.40 (m, 6H)
434	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.36 (s, 1H), 9.08 (s, 1H), 8.69 (d, J=5.0 Hz, 1H), 8.49 (d, J=8.2 Hz, 1H), 8.36 (s, 1H), 8.18 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.88 (d, J=8.8 Hz, 1H), 7.63-7.68 (m, 2H), 4.96-5.14 (m, 1H), 1.51 (d, J=7.1 Hz, 3H)
435	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.36 (d, J=7.1 Hz, 1H), 9.08 (s, 1H), 8.69 (d, J=5.2 Hz, 1H), 8.50 (ddd, J=8.4, 2.7, 1.4 Hz, 1H), 8.31-8.41 (m, 1H), 8.25 (br s, 1H), 7.88 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.63-7.69 (m, 2H), 6.14 (t, J=4.3 Hz, 1H), 3.84 (tdd, 2H)

436	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.36 (d, J=7.1 Hz, 1H), 9.08 (s, 1H), 8.69 (d, J=5.2 Hz, 1H), 8.50 (ddd, J=8.4, 2.7, 1.4 Hz, 1H), 8.31-8.41 (m, 1H), 8.25 (br s, 1H), 7.88 (d, J=8.7 Hz, 1H), 7.63-7.69 (m, 2H), 6.14 (t, J=4.3 Hz, 1H), 3.84 (tdd, 2H)
437	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.35 (s, 1H), 9.05 (s, 1H), 8.68 (d, J=5.0 Hz, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.48 (d, J=8.2 Hz, 1H), 8.31 (s, 1H), 7.85 (dd, J=8.8, 0.9 Hz, 2H), 7.56-7.74 (m, 2H), 4.08 (dd, J=6.6, 5.2 Hz, 1H), 3.86 (ddd, J=8.1, 7.2, 6.1 Hz, 1H), 3.69 (td, J=7.7, 6.5 Hz, 1H), 3.40-3.58 (m, 2H), 2.00-2.08 (m, 5H), 1.83-1.94 (m, 2H), 1.70 (dd, J=12.1, 8.7 Hz, 1H)
438	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.04-9.20 (m, 2H), 8.79 (dd, J=4.7, 1.4 Hz, 1H), 8.36 (dd, J=7.1, 1.1 Hz, 1H), 8.16 (ddd, J=8.2, 2.6, 1.5 Hz, 1H), 7.79 (dd, J=8.4, 1.1 Hz, 1H), 7.57 (ddd, J=8.2, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 7.33 (dd, J=8.4, 7.0 Hz, 1H), 4.15 (dd, J=6.4, 3.9 Hz, 1H), 3.72-3.91 (m, 3H), 3.62 (dt, J=13.9, 6.0 Hz, 1H), 1.95-2.11 (m, 1H), 1.84-1.95 (m, 2H), 1.69 (dd, J=12.2, 8.7 Hz, 2H)
439	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.51 (s, 1H), 8.74-8.84 (m, 3H), 8.55 (dt, J=7.9, 2.0 Hz, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.96 (d, J=8.5 Hz, 1H), 7.87 (d, J=8.4 Hz, 1H), 7.72 (br s, 1H), 7.51 (ddd, J=6.4 Hz, 1H), 7.26-7.31 (m, 2H), 4.97 (d, J=4.4 Hz, 2H)
440	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.50 (dd, J=2.1, 0.9 Hz, 1H), 8.80 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.53 (dt, J=8.0, 2.0 Hz, 1H), 8.12-8.17 (m, 1H), 7.77-7.87 (m, 2H), 7.50 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.9 Hz, 1H), 6.64 (br s, 1H), 4.11 (dd, J=7.3, 3.2 Hz, 1H), 3.77-3.95 (m, 4H), 3.38 (ddd, J=13.8, 7.6, 4.7 Hz, 1H), 2.02-2.12 (m, 2H), 1.87-2.01 (m, 3H), 1.56-1.76 (m, 4H)
441	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.49 (d, J=1.6 Hz, 1H), 8.80 (dd, J=4.9, 1.6 Hz, 1H), 8.53 (d, J=7.9 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.74-7.84 (m, 2H), 7.50 (ddd, J=6.6 Hz, 1H), 6.06 (d, J=7.3 Hz, 1H), 4.34 (dt, J=7.7, 6.6 Hz, 1H), 1.28-1.33 (m, 6H)
442	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:8.74 (d, J=2.0 Hz, 1H), 8.47 (dd, J=4.7, 1.2 Hz, 1H), 7.96-8.18 (m, 3H), 7.78-7.94 (m, 4H), 7.67 (d, J=8.2 Hz, 2H), 7.54-7.63 (m, 2H), 7.42-7.53 (m, 3H), 7.35 (ddd, J=8.2, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 3.91-4.00 (m, 9H), 1.72 (br s, 8H)
443	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.50 (d, J=1.6 Hz, 1H), 8.82 (dd, J=4.7, 1.6 Hz, 1H), 8.54 (d, J=8.0 Hz, 1H), 8.14 (dd, J=1.6, 0.6 Hz, 1H), 7.77-7.90 (m, 2H), 7.51 (t, J=6.5 Hz, 1H), 6.47 (br s, 1H), 4.18-4.31 (m, 2H)
444	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.20 (d, J=2.2 Hz, 1H), 9.14 (br s, 1H), 8.73 (d, J=5.2 Hz, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.35 (d, J=7.1 Hz, 1H), 8.20 (d, J=8.3 Hz, 1H), 7.88 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.56 (ddd, J=8.2, 4.8, 0.7 Hz, 1H), 7.29 (t, J=7.5 Hz, 1H), 3.08 (dt, J=7.3, 3.6 Hz, 1H), 0.87-1.01 (m, 2H), 0.65-0.80 (m, 5H),
445	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.51 (s, 1H), 8.81 (d, J=3.5 Hz, 1H), 8.54 (d, J=7.9 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.77-7.87 (m, 2H), 7.51 (t, J=6.6 Hz, 1H), 6.42 (br s, 1H), 4.54 (t, J=5.1 Hz, 1H), 3.67 (t, J=5.4 Hz, 2H), 3.47 (s, 6H)
446	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.50 (s, 1H), 8.81 (d, J=3.9 Hz, 1H), 8.53 (d, J=7.9 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.78-7.86 (m, 2H), 7.50 (dd, J=7.7, 4.7 Hz, 1H), 7.26 (s, 1H), 6.32 (br s, 1H), 3.38 (dd, J=7.3, 5.4 Hz, 2H), 1.04-1.18 (m, 1H), 0.54-0.65 (m, 2H), 0.27-0.37 (m, 2H)

447	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.49 (d, J=1.6 Hz, 1H), 8.80 (dd, J=4.7, 1.6 Hz, 1H), 8.53 (dt, J=8.0, 1.9 Hz, 1H), 8.10 (d, J=1.6 Hz, 1H), 7.77-7.85 (m, 1H), 7.73 (dd, J=8.4, 1.6 Hz, 1H), 7.50 (ddd, J=8.0, 4.9, 0.8 Hz, 1H), 6.35 (br s, 1H), 2.96 (dd, J=7.0, 3.9 Hz, 1H), 0.84-1.00 (m, 2H), 0.62-0.74 (m, 2H)
448	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.50 (d, J=1.4 Hz, 1H), 8.81 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.53 (dt, J=8.0, 1.9 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.81-7.99 (m, 2H), 7.39-7.56 (m, 1H), 7.26 (s, 3H), 3.83 (s, 2H)
449	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.39-9.47 (m, 1H), 8.83 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.59 (d, J=7.8 Hz, 1H), 8.25 (d, J=1.6 Hz, 1H), 8.16 (br s, 1H), 8.00 (d, J=8.2 Hz, 1H), 7.86 (d, J=8.1 Hz, 1H), 7.65 (t, J=6.7 Hz, 1H), 3.72 (td, J=7.0, 5.8 Hz, 2H), 2.64 (tdd, 2H)
450	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:10.09-10.35 (m, 1H), 9.53 (dd, J=8.8 Hz, 1H), 8.74 (dd, J=4.8, 1.7 Hz, 1H), 8.67 (dd, J=11.3 Hz, 1H), 8.06 (dd, J=7.6, 1.1 Hz, 1H), 7.75 (dd, J=8.0, 1.1 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J=8.0, 4.8, 0.8 Hz, 1H), 7.40 (t, J=7.7 Hz, 1H), 3.81 (td, J=6.7, 5.8 Hz, 2H), 2.86 (t, J=6.7 Hz, 2H), 2.22 (s, 2H)
451	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:12.46 (br s, 1H), 10.36 (br s, 1H), 9.44 (br s, 1H), 8.71 (d, J=3.9 Hz, 1H), 8.53 (br s, 1H), 8.03 (br s, 1H), 7.44-7.58 (m, 2H), 7.21 (br s, 1H), 4.66 (br s, 1H), 3.82 (br s, 2H), 3.50 (s, 5H)
452	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.12-9.24 (m, 1H), 8.58 (d, J=3.6 Hz, 1H), 8.23 (d, J=8.0 Hz, 1H), 7.66 (br s, 1H), 7.21-7.34 (m, 2H), 7.17 (d, J=7.4 Hz, 1H), 7.06-7.14 (m, 1H), 3.17 (br s, 6H)
453	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:10.32-10.42 (m, 1H), 9.81-9.95 (m, 1H), 9.24-9.34 (m, 1H), 8.68-8.82 (m, 1H), 8.41 (d, J=8.6 Hz, 1H), 8.15-8.29 (m, 1H), 7.65-7.76 (m, 1H), 7.49-7.59 (m, 1H), 7.47 (s, 1H), 4.30 (s, 2H)
454	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:13.25 (br s, 1H), 10.39 (s, 1H), 9.54 (s, 1H), 8.70 (d, J=3.8 Hz, 1H), 8.63 (d, J=7.9 Hz, 1H), 8.04 (d, J=7.4 Hz, 1H), 7.39-7.51 (m, 2H), 7.16 (t, J=7.8 Hz, 1H), 1.63 (s, 9H)
462	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.41 (d, J=0.9 Hz, 1H), 9.10 (t, J=1.7 Hz, 1H), 8.62 (t, J=5.8 Hz, 1H), 8.35-8.40 (m, 1H), 8.31 (ddd, J=6.5, 1.6, 0.8 Hz, 1H), 8.11 (ddd, J=8.5, 1.9, 0.8 Hz, 1H), 7.82 (dd, J=9.1, 1.6 Hz, 1H), 7.76 (dt, J=9.1, 0.9 Hz, 1H), 7.64 (dd, J=8.5, 6.5 Hz, 1H), 4.01 (t, J=6.3 Hz, 1H), 3.80 (ddd, J=8.1, 7.1, 6.1 Hz, 1H), 3.58-3.70 (m, 1H), 3.28-3.39 (m, 3H), 1.78-1.97 (m, 3H), 1.57-1.67 (m, 1H)
463	<sup>1</sup> H NMR (DMSO- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.49 (s, 1H), 9.46 (s, 1H), 8.88 (t, J=5.5 Hz, 1H), 8.76 (d, J=5.2 Hz, 1H), 8.70-8.74 (m, 1H), 8.43 (s, 1H), 7.78-7.86 (m, 3H), 3.72-3.83 (m, 2H), 3.62 (q, J=6.2 Hz, 2H)
464	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.08 (s, 1H), 9.00 (t, J=1.7 Hz, 1H), 8.12-8.28 (m, 1H), 7.85-8.06 (m, 1H), 7.80 (dd, J=8.4, 1.1 Hz, 1H), 7.41 (dd, J=8.4, 6.5 Hz, 1H), 7.31-7.36 (m, 1H), 6.48 (br s, 1H), 2.96 (dd, J=7.1, 3.9 Hz, 1H), 0.84-0.99 (m, 2H), 0.61-0.76 (m, 2H)
465	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:8.99-9.09 (m, 3H), 8.21 (d, J=6.6 Hz, 2H), 7.84-7.96 (m, 2H), 7.80 (dt, J=8.4, 0.9 Hz, 2H), 7.30-7.47 (m, 5H), 6.17 (d, J=7.7 Hz, 2H), 3.98-4.19 (m, 2H), 2.09 (dd, J=12.5, 3.2 Hz, 4H), 1.80 (dt, J=13.8, 3.7 Hz, 4H), 1.69 (dt, J=13.0, 3.7 Hz, 2H), 1.41-1.55 (m, 4H), 1.23-1.36 (m, 5H)

466	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:8.91-9.08 (m, 2H), 8.23 (d, J=6.8 Hz, 1H), 7.95 (d, J=8.7 Hz, 2H), 7.81 (dd, J=8.4, 1.1 Hz, 2H), 7.34-7.56 (m, 4H), 6.61 (br s, 1H), 4.16-4.36 (m, 2H)
467	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ:9.19 (d, 1H), 8.63 (dd, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.26 (dt, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.39 (dd, 1H), 7.16 (dd, 1H), 7.00 (s, 1H), 6.60 (br s, 1H), 4.10 (qd, 1H), 3.93 (dt, 1H), 3.89-3.76 (m, 2H), 3.38-3.29 (m, 1H), 2.11-2.02 (m, 1H), 2.00-1.83 (m, 3H)
504	<sup>1</sup> H NMR (丙酮- <i>d</i> <sub>6</sub> ) δ:9.29-9.35 (m, 2H), 8.62 (d, J=2.4 Hz, 1H), 8.46 (d, J=9.8 Hz, 1H), 7.89 (d, J=8.8 Hz, 2H), 7.68 (d, J=6.6 Hz, 1H), 7.42 (dd, J=7.5 Hz, 1H), 4.62 (t, J=5.5 Hz, 1H), 3.57 (t, J=5.8 Hz, 2H), 3.39 (s, 6H)

- a <sup>1</sup>H NMR 數據係在四甲基矽烷低場區的 ppm。偶合係由下列符號表示：  
 (s)-單峰，(d)-雙重峰，(t)-三重峰，(m)-多重峰，(dd)-雙重雙重峰，(dt)-雙重三重峰，(br)-寬峰。

### 本發明之生物性實例

#### 測試 A 至 F 之配方與噴灑方法

**【0354】** 使用含有 10%丙酮、90%水及含有烷芳基聚氧乙烯、游離脂肪酸、二醇類及異丙醇的 300 ppm X-77® Spreader Lo-Foam Formula 非離子界面活性劑 ( Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, USA ) 的溶液配製測試化合物。在每個測試單元頂部之上 1.27 cm ( 0.5 英吋 ) 的位置，透過具有 1/8 JJ 定製體的 SUJ2 霧化器噴嘴 ( Spraying Systems Co. Wheaton, Illinois, USA ) 施用 1 mL 配製好的化合物液體。以指定施用率噴灑測試化合物，各測試重複三次。

#### 測試 A

**【0355】** 為了評估菱紋背蛾 (*Plutella xylostella* (L.)) 之防治效果，測試單元係由內有一 12 到 14 天齡之芥菜植栽的小開放容器組成。此測試單元係經約 50 隻新生幼蟲預先侵染，這些幼蟲係使用接種



器經由玉米桿粗磨粉分配至測試單元內。在分配進測試單元後，幼蟲會移動至測試植物上。

**【0356】** 配製測試化合物然後以 250 及/或 50 ppm 噴灑。在噴灑配製的測試化合物後，讓各測試單元乾燥 1 小時然後將黑色網罩置於頂部。在 25°C 及 70%相對濕度下使測試單元於生長腔室中保持 6 天。接著目視觀察，根據吃掉的葉子評估植物攝食損傷，並且評估幼蟲的死亡率。

**【0357】** 在 250 ppm 的式 1 化合物之測試中，下列提供非常良好到極佳的防治效力水準（40%或更低的攝食損傷與/或 100%死亡率）：309、501、502、344、431 及 466。

### 測試 B

**【0358】** 為了評估經由接觸及/或系統方式對馬鈴薯葉蟬 (*Empoasca fabae* (Harris))的防治效果，測試單元係由內部具有 5 至 6 天齡太陽豆(Soleil bean)植物（長出初生葉）的小開放容器組成。將白砂加至土壤頂部，然後在施用測試化合物前將其中一片初生葉切下。

**【0359】** 配製測試化合物然後以 250 及/或 50 ppm 噴灑。在噴灑配製的測試化合物後，讓各測試單元乾燥 1 小時之後，用 5 隻馬鈴薯葉蟬（18 至 21 天齡成蟲）後侵染。將黑色網罩置於測試單元頂部，然後在 24°C 及 70%相對濕度下使測試單元於生長腔室中保持 6 天。隨後目視評估每一測試單元的昆蟲死亡率。

【0360】 在 250 ppm 的式 1 化合物之測試中，下列導致至少 80%的死亡率：21、130、131、133、300、301、309、366、367、368、370、375、380、382、386、387、388、409 與 466。

【0361】 在 50 ppm 的式 1 化合物之測試中，下列導致至少 80%的死亡率：301、309、375、380、382、386、387 及 388。

### 測試 C

【0362】 為了評估經由接觸及/或系統方式對綠桃蚜 (*Myzus persicae* (Sulzer))的防治，測試單元係由內部具有 12 至 15 天齡蘿蔔植物的小開放容器組成。此係藉由將自培養植物切下之葉片上的 30—40 個蚜蟲置放於測試植物之葉片來預侵染（切葉法）。當葉片變乾時，蚜蟲移動至測試植物上。在預侵染後，以一層砂覆蓋測試單元之土壤。

【0363】 配製測試化合物然後以 250 及/或 50 ppm 噴灑。在噴灑配製的測試化合物後，讓各測試單元乾燥 1 小時然後將黑色網罩置於頂部。在 19–21°C 及 50–70%相對濕度下使測試單元於生長腔室中保持 6 天。隨後目視評估每一測試單元的昆蟲死亡率。

【0364】 在 250 ppm 的式 1 化合物之測試中，下列導致至少 80%的死亡率：1、6、7、8、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、24、25、26、27、28、34、35、36、37、39、41、42、44、46、49、51、52、53、54、55、56、57、58、60、61、62、63、64、66、67、68、69、70、72、73、74、75、76、

78、79、81、84、85、86、92、96、97、98、100、102、106、  
111、114、117、118、121、122、124、125、131、132、133、  
160、161、162、163、173、300、301、308、309、320、321、  
322、323、324、326、329、330、331、332、333、334、335、  
336、338、340、341、342、343、344、345、346、348、350、  
351、352、353、354、363、364、366、370、372、374、375、  
376、377、378、380、381、382、387、388、393、400、401、  
402、403、404、409、410、411、412、413、415、416、419、  
439、440、442、443、444、445、446、447、448、449、455、  
456、462、463、464、500、501、502 與 503。

【0365】 在 50 ppm 的式 1 化合物之測試中，下列導致至少 80%  
的死亡率：6、7、8、10、11、12、13、14、16、17、18、19、21、  
24、25、26、27、28、34、35、36、37、39、41、42、46、49、  
51、52、53、54、55、56、57、58、60、62、63、64、66、67、  
68、69、73、75、76、78、81、84、85、86、96、121、122、124、  
125、131、132、133、160、161、162、163、300、308、309、  
320、322、323、324、325、326、329、330、331、332、333、  
334、335、336、338、340、342、343、344、345、346、348、  
350、351、352、353、354、366、374、375、376、378、380、  
382、387、388、401、402、403、404、409、410、411、412、  
413、415、419、440、443、444、445、446、447、448、455、  
462、463、464、500、501、502 與 503。

## 測試 D

【0366】 為了評估經由接觸及/或系統方式對棉瓜蚜 (*Aphis gossypii* (Glover)) 的防治，測試單元係由內部具有 6 至 7 天齡棉花植物之小開放容器組成。此係按照切葉法用一片葉子上的 30-40 隻昆蟲預侵染，然後將測試單元的土壤蓋上一層砂。

【0367】 配製測試化合物然後以 250 及/或 50 ppm 噴灑。在噴灑後，在 19°C 及 70% 相對濕度下將測試單元於生長腔室中保持 6 天。隨後目視評估每一測試單元的昆蟲死亡率。

【0368】 在 250 ppm 的式 1 化合物之測試中，下列導致至少 80% 的死亡率：6、7、8、11、12、14、16、19、21、24、25、37、39、40、41、51、52、54、55、58、62、63、64、66、67、68、69、70、79、96、131、133、160、161、309、323、336、342、345、348、350、351、353、366、401、403、412、419、440、444、447、455、462、464、500、501 與 503。

【0369】 在 50 ppm 的式 1 化合物之測試中，下列導致至少 80% 的死亡率：6、8、14、16、19、21、24、39、41、42、51、52、54、55、58、67、76、131、133、323、348、351、401 與 403。

## 測試 E

【0370】 為了評估經由接觸及/或系統方式對西方花薊馬 (*Frankliniella occidentalis* (Pergande)) 之防治，測試單元係由內部具有 5 至 7 天齡太陽豆(Soleil bean)植物之小開放容器組成。

【0371】 配製測試化合物然後以 250 及/或 50 ppm 噴灑。在噴灑後，讓測試單元乾燥 1 小時，然後將 22-27 隻薊馬成蟲加至各單元中。將黑色網罩置於頂部，然後在 25°C 及 45-55%相對濕度下將測試單元保持 6 天。

【0372】 在 250 ppm 的式 1 化合物之測試中，以下化合物提供非常良好到極佳之防治效力（30%或更低的植物損傷及/或 100%死亡率）：13、64、68、70、72、131、132、133、314、340、348、367、409、410、415、464 與 504。

#### 測試 F

【0373】 為了評估經由接觸及/或系統方式對甘薯粉虱(*Bemisia tabaci* (Gennadius))的防治，測試單元係由內部具有 12 至 14 天齡棉花植物之小開放容器組成。在噴灑施用之前，將兩片子葉從植栽上移除，留下一片真葉以供評估。讓粉虱成蟲將卵下在植栽上然後將成蟲從測試單元中移出。將受到至少 15 顆卵侵染的棉花植栽送交噴灑測試。

【0374】 配製測試化合物然後以 250 及/或 50 ppm 噴灑。在噴灑後，讓測試單元乾燥 1 小時。接著將圓筒移除，然後將單元移至生長

腔室並在 28°C 與 50–70%相對濕度下保持 13 天。隨後目視評估每一測試單元的昆蟲死亡率。

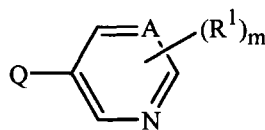
**【0375】** 在 250 ppm 的式 1 化合物之測試中，下列導致至少 50%的死亡率：8、42、58、63、64、68、72、321、324、326、330、334、339、340、348、349、360、366、368、402、403、412、456 與 463。

**【0376】** 在 50 ppm 的式 1 化合物之測試中，下列導致至少 50%的死亡率：326。

**【符號說明】**

# 申請專利範圍

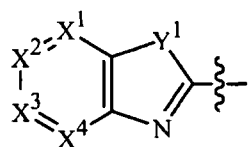
1. 一種選自式 1、其 *N*-氧化物或鹽之化合物，



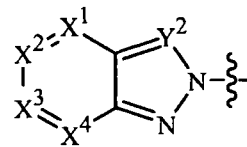
1

其中

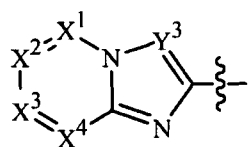
Q 為



Q-1

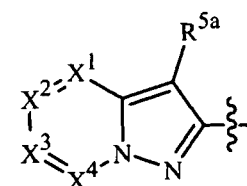


Q-2



Q-3

或



Q-4

A 為 CH、CR<sup>1</sup> 或 N；

各 R<sup>1</sup> 獨立為鹵素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷硫基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷硫基；

m 為 0、1、2 或 3；

X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup> 及 X<sup>4</sup> 各獨立為 CR<sup>2</sup>、CR<sup>3</sup> 或 N，前提是(i) X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup> 及 X<sup>4</sup> 其中一者為 CR<sup>2</sup>，且(ii) X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup> 及 X<sup>4</sup> 中不超過一者為 N；

R<sup>2</sup> 為 C(=Z)NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、N(R<sup>8</sup>)C(=Z)R<sup>9</sup>、C(=NR<sup>10</sup>)R<sup>11</sup> 或 Q<sup>a</sup>；

各 Z 獨立為 O 或 S；

各  $R^3$  獨立為 H、鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、  
 $C_1-C_4$  烷氧基或  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

$Y^1$  為 O、S 或  $NR^4$ ；

$Y^2$  為 N 或  $CR^{5a}$ ；

$Y^3$  為 N 或  $CR^{5b}$ ；

$R^4$  為 H 或  $C_1-C_4$  烷基；

$R^{5a}$  為 H、鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$   
鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基或  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

$R^{5b}$  為 H、鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$   
鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基或  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

$R^6$  為 H、 $NR^{15}R^{16}$ 、 $OR^{17}$ 、 $C(=NR^{10})R^{11}$ 、 $C(O)OR^{21}$ 、  
 $C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $C(O)R^{22}$ 、 $S(O)_nR^{23}$  或  $Q^b$ ；或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_6$   
 $C_6$  環烷基、 $C_2-C_6$  烯基或  $C_2-C_6$  炔基，各為未經取代或經至少  
一個  $R^x$  取代；

$R^7$  為 H 或  $Q^b$ ；或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_2-C_6$  烯基或  $C_2-C_6$   
炔基，各為未經取代或經至少一個  $R^x$  取代；或

$R^6$  及  $R^7$  係與它們所接附之氮原子一併考量而形成一 3 至 10 員環，  
該環含有選自碳原子與至多 2 個雜原子之環員，該至多 2 個雜  
原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 2 個氮原子，  
其中至多 2 個碳原子環員係獨立選自  $C(=O)$  與  $C(=S)$  且該硫原



子環員係選自 S、S(O)或 S(O)<sub>2</sub>，該環為未經取代或經至多 4 個 R<sup>x</sup> 取代；或

R<sup>6</sup> 及 R<sup>7</sup> 係一併考量而為 =S(O)<sub>p</sub>R<sup>18</sup>R<sup>19</sup> 或 =S(=NR<sup>20</sup>)R<sup>18</sup>R<sup>19</sup>；

各 R<sup>x</sup> 獨立為鹵素、氰基、硝基、羥基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 鹵烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 鹵烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷氧基、C(=NR<sup>10</sup>)R<sup>11</sup>、C(O)OR<sup>21</sup>、C(O)NR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>、OC(O)R<sup>22</sup>、NR<sup>25</sup>R<sup>26</sup>、NR<sup>24</sup>C(O)R<sup>22</sup>、C(O)R<sup>22</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>23</sup>、Si(R<sup>28</sup>)<sub>3</sub>、OSi(R<sup>28</sup>)<sub>3</sub> 或 Q<sup>b</sup>；

R<sup>8</sup> 為 H、C(O)OR<sup>21</sup>、C(O)NR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>、C(O)R<sup>22</sup>、S(O)<sub>n</sub>R<sup>23</sup> 或 Q<sup>b</sup>；或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基或 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基，各為未經取代或經至少一個 R<sup>x</sup> 取代；

R<sup>9</sup> 為 H、C(=NR<sup>10</sup>)R<sup>11</sup>、OR<sup>21</sup> 或 NR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>；或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基或 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基，各為未經取代或經至少一個 R<sup>x</sup> 取代；或苯基、苯氧基或一 5 或 6 員雜環芳環，各為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基及 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷氧基；或一 3 至 6 員雜環非芳環，各環含有選自碳原子與至多 3 個雜原子之環員，該至多 3 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 2 個氮原子，其中至多 1 個碳原子環員係獨立選自 C(=O)與 C(=S)且該硫原子環員係選自 S、S(O)或 S(O)<sub>2</sub>，各環為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰

基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{10}$  獨立為  $OR^{12}$ 、 $S(O)_nR^{13}$  或  $NHR^{14}$ ；

各  $R^{11}$  獨立為 H；或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_2-C_6$  烯基或  $C_2-C_6$  炔基，各為未經取代或經至少一個  $R^x$  取代；或  $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  鹵烷氧基、 $C_3-C_6$  環烷氧基、 $C(O)OR^{21}$ 、 $C(O)NR^{15}R^{16}$ 、 $NR^{25}R^{26}$ 、 $NR^{24}C(O)R^{22}$ 、 $C(O)R^{22}$  或  $Q^b$ ；

各  $R^{12}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C(O)R^{22}$ 、 $S(O)_nR^{13}$  或  $Q^b$ ；

各  $R^{13}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基或  $C_1-C_4$  鹵烷基；

$R^{14}$  為  $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C(O)R^{22}$  或  $C(O)OR^{21}$ ；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{15}$  獨立為 H、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C(O)R^{27}$  或  $S(O)_2R^{27}$ ；或苯基或一 5 或 6 員雜環芳環，各為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{16}$  獨立為 H、 $C_1-C_6$  烷基或  $C_1-C_4$  鹵烷基；或

$R^{15}$  及  $R^{16}$  係與它們所接附之氮原子一併考量而形成一 3 至 7 員環，該環含有選自碳原子與至多 2 個雜原子之環員，該至多 2 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 2 個氮原子，其中至多 2 個碳原子環員係獨立選自  $C(=O)$  與  $C(=S)$  且該硫原子環員係選自  $S$ 、 $S(O)$  或  $S(O)_2$ ，該環為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

$R^{17}$  為  $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基或  $C_1-C_4$  鹵烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{18}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基或  $C_1-C_4$  鹵烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{19}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基或  $C_1-C_4$  鹵烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；或

$R^{18}$  及  $R^{19}$  係與它們所接附之硫原子一併考量而形成一環；

$R^{20}$  為 H、氰基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基或  $C(O)R^{22}$ ；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{21}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_3-C_6$  環烷基或  $C_3-C_6$  鹵環烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{22}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_3-C_6$  環烷基或  $C_3-C_6$  鹵環烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{23}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_3-C_6$  鹵環烷基、 $C_3-C_6$  環烷烷基或  $C_3-C_6$  鹵環烷烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{24}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基；

各  $R^{25}$  獨立為 H、 $C_1-C_4$  烷基或  $C_1-C_4$  鹵烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：

鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{26}$  獨立為  $C_1-C_4$  烷基或  $C_1-C_4$  鹵烷基；或苯基，其為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；或

$R^{25}$  及  $R^{26}$  係獨立與它們所接附之氮原子一併考量而形成一 3 至 7 員環，該環含有選自碳原子與至多 2 個雜原子之環員，該至多 2 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 2 個氮原子，其中至多 2 個碳原子環員係獨立選自  $C(=O)$  與  $C(=S)$  且該硫原子環員係選自  $S$ 、 $S(O)$  或  $S(O)_2$ ，該環為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{27}$  獨立為  $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  鹵烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  鹵烷氧基或  $NR^{29}R^{30}$ ；或苯基或一 5 或 6 員雜環芳環，各為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基及  $C_1-C_4$  鹵烷氧基；

各  $R^{28}$  獨立為  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基或苯基；

各  $R^{29}$  獨立為  $H$  或  $Q^b$ ；或  $C_1-C_6$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_2-C_6$  烯基或  $C_2-C_6$  炔基；各為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所

組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基及 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷氧基；

各 R<sup>30</sup> 獨立為 H 或 Q<sup>b</sup>；或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基或 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 炔基；各為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基及 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷氧基；或

R<sup>29</sup> 及 R<sup>30</sup> 係與它們所接附之氮原子一併考量而形成一 3 至 10 員環，該環含有選自碳原子與至多 2 個雜原子之環員，該至多 2 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 2 個氮原子，其中至多 2 個碳原子環員係獨立選自 C(=O)與 C(=S)且該硫原子環員係選自 S、S(O)或 S(O)<sub>2</sub>，該環為未經取代或經至多 4 個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基及 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷氧基；

Q<sup>a</sup> 為一 5 至 10 員芳環或環系，各環或環系含有選自碳原子與至多 3 個雜原子之環員，該至多 3 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 3 個氮原子，其中至多 2 個碳原子環員係獨立選自 C(=O)與 C(=S)且該硫原子環員係選自 S、S(O)或 S(O)<sub>2</sub>，各環或環系為未經取代或經至少一個 R<sup>x</sup> 取代；或一 3 至 6 員部分飽和環，各環含有選自碳原子與至多 2 個雜原子之

環員，該至多 2 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 2 個氮原子，其中至多 2 個碳原子環員係獨立選自 C(=O)與 C(=S)且該硫原子環員係選自 S、S(O)或 S(O)<sub>2</sub>，各環為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基及 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷氧基；

各 Q<sup>b</sup> 獨立為苯基、一 5 或 6 員雜環芳環或一 3 至 6 員雜環非芳環，各環含有選自碳原子與至多 2 個雜原子之環員，該至多 2 個雜原子係獨立選自一個氧原子、一個硫原子與至多 2 個氮原子，其中至多 2 個碳原子環員係獨立選自 C(=O)與 C(=S)且該硫原子環員係選自 S、S(O)或 S(O)<sub>2</sub>，各環為未經取代或經至少一個獨立選自由下列所組成之群組的取代基取代：鹵素、氰基、硝基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基及 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷氧基；

各 n 獨立為 0、1 或 2；以及

p 為 1 或 2。

2. 如請求項 1 之化合物，其中

X<sup>1</sup> 為 CR<sup>2</sup>，且 X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup> 及 X<sup>4</sup> 各獨立為 CR<sup>3</sup>；或 X<sup>2</sup> 為 CR<sup>2</sup>，以及

X<sup>1</sup>、X<sup>3</sup> 及 X<sup>4</sup> 各獨立為 CR<sup>3</sup>。

3. 如請求項 2 之化合物，其中

Q 為 Q-1 或 Q-2。

4. 如請求項 3 之化合物，其中

Q 為 Q-1；以及

$Y^1$  為 O 或 S。

5. 如請求項 3 之化合物，其中

Q 為 Q-2；以及

$Y^2$  為  $CR^{5a}$ 。

6. 如請求項 2 至 5 中任一項之化合物，其中

A 為 CH 或 CF；以及

m 為 0。

7. 如請求項 1 之化合物，其係選自由下列所組成之群組：

*N*-(1-甲基乙基)-2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-4-甲醯胺；

*N*-環丙基-2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-4-甲醯胺；

*N*-環己基-2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-4-甲醯胺；

2-(3-吡啶基)-*N*-(2,2,2-三氟乙基)-2*H*-吡啶-4-甲醯胺；

2-(3-吡啶基)-*N*-[(四氫-2-呋喃基)甲基]-2*H*-吡啶-5-甲醯胺；

2-[[2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-5-基]羰基]胍甲酸甲酯；

*N*-[(2,2-二氟環丙基)甲基]-2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-5-甲醯胺；

*N*-(2,2-二氟丙基)-2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-5-甲醯胺；

2-(3-吡啶基)-*N*-(2-噁啶甲基)-2*H*-吡啶-5-甲醯胺；以及

*N*-[(5-甲基-2-吡【口+井】基)甲基]-2-(3-吡啶基)-2*H*-吡啶-5-甲醯胺。



8. 一種組成物，其包含一請求項 1 之化合物與至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑與液體稀釋劑所組成之群組的額外組分，該組成物可選擇地進一步包含至少一種額外生物活性化合物或藥劑。
9. 如請求項 8 之組成物，其中該至少一種額外生物活性化合物或藥劑係選自由下列所組成之群組：阿巴汀(abamectin)、毆殺松(acephate)、亞醜蟎(acequinocyl)、亞滅培(acetamiprid)、阿納寧(acrinathrin)、afidopyropen、磺胺蟎酯(amidoflumet)、三亞蹠(amitraz)、阿維菌素(avermectin)、印棟素(azadirachtin)、谷速松(azinphos-methyl)、免扶克(benfuracarb)、免速達(bensultap)、畢芬寧(bifenthrin)、聯苯胼酯(bifenazate)、雙三氟蟲脲(bistrifluron)、硼酸鹽(borate)、布芬淨(buprofezin)、硫線磷(cadusafos)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、培丹(cartap)、酸酯蟎(carzol)、剋安勃(chlorantraniliprole)、克凡派(chlorfenapyr)、克福隆(chlorfluazuron)、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、可芬諾(chromafenozide)、克芬蟎(clofentezin)、可尼丁(clothianidin)、氰特破(cyantraniliprole)、cyclaniliprole、乙氰菊酯(cycloprothrin)、環氧蟲啉(cycloxaprid)、賽芬蟎(cyflumetofen)、賽扶寧(cyfluthrin)、貝他賽扶寧(beta-cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、伽瑪賽洛寧(gamma-cyhalothrin)、拉目達賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、亞滅寧(alpha-cypermethrin)、傑他賽滅寧(zeta-cypermethrin)、賽滅淨(cyromazine)、第滅寧(deltamethrin)、汰芬隆(diafenthiuron)、大利

松(diazinon)、地特靈(diieldrin)、二福隆(diflubenzuron)、四氟甲醚菊酯(dimefluthrin)、殺蟲雙(dimehypo)、大滅松(dimethoate)、達特南(dinotefuran)、苯蟲醚(diofenolan)、因滅汀(emamectin)、安殺番(endosulfan)、益化利(esfenvalerate)、乙蟲清(ethiprole)、依芬寧(etofenprox)、依殺蟎(etoxazole)、芬佈賜(fenbutatin oxide)、撲滅松(fenitrothion)、芬硫克(fenothiocarb)、芬諾克(fenoxycarb)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、芬普尼(fipronil)、flometoquin、氟尼胺(flonicamid)、氟蟲醯胺(flubendiamide)、護賽寧(flucythrinate)、嘍蟲胺(flufenerim)、氟芬隆(flufenoxuron)、氟菌蟎酯(flufenoxystrobin)、氟嚙蟲磺(fluensulfone)、氟吡菌醯胺(fluopyram)、弗盧皮拉蒂(flupyradifurone)、福化利(flualinate)、陶 - 福化利 (tau-flualinate)、大福松 (fonophos)、覆滅蟎(formetanate)、福賽絕(fosthiazate)、合芬隆(halofenozide)、氯氟醚菊酯 (heptafluthrin)、六伏隆 (hexaflumuron)、合賽多(hexythiazox)、愛美松(hydramethylnon)、益達胺(imidacloprid)、因得克(indoxacarb)、殺蟲肥皂(insecticidal soaps)、亞芬松(isofenphos)、祿芬隆(lufenuron)、馬拉松(malathion)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、美氟綜(metaflumizone)、滅蝸靈(metaldehyde)、達馬松(methamidophos)、滅大松(methidathion)、滅賜克(methiodicarb)、納乃得(methomyl)、美賜平(methoprene)、甲氧 DDT (methoxychlor)、滅芬諾(methoxyfenozide)、美特寧(metofluthrin)、亞素靈(monocrotophos)、monofluorothrin、菸鹼

(nicotine)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、尼殺賽(nithiazine)、諾伐隆(novaluron)、諾伏隆(noviflumuron)、毆殺滅(oxamyl)、巴拉松(parathion)、甲基巴拉松(parathion-methyl)、百滅寧(permethrin)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosalone)、益滅松(phosmet)、福賜米松(phosphamidon)、比加普(pirimicarb)、佈飛松(profenofos)、佈福靈(profluthrin)、毆蟎多(propargite)、佈芬佈(protrifenbute)、pyflubumide、派滅淨(pymetrozine)、派福羅(pyrafluprole)、除蟲菊精(pyrethrin)、畢達本(pyridaben)、啶蟲丙醚(pyridalyl)、披福貴(pyrifluquinazon)、啞蟎胺(pyriminostrobin)、披綠羅(pyriprole)、百利普芬(pyriproxyfen)、魚藤精(rotenone)、阿諾鹼(ryanodine)、矽護芬(silafluofen)、賜托拉(spinetoram)、賜諾殺(spinosad)、賜派芬(spirodiclofen)、螺甲蟎酯(spiromesifen)、螺蟲乙酯(spirotetramat)、甲丙硫磷(sulprofos)、賜殺羅(sulfoxaflor)、得芬諾(tebufenozide)、得芬瑞(tebufenpyrad)、得福(teflubenzuron)、七氟菊酯(tefluthrin)、托福松(terbufos)、殺蟲畏(tetrachlorvinphos)、治滅寧(tetramethrin)、四甲氟菊酯(tetramethylfluthrin)、賽果培(thiacloprid)、賽速安(thiamethoxam)、硫敵克(thiodicarb)、殺蟲單(thiosultap-sodium)、tioazafen、脫芬瑞(tolfenpyrad)、泰滅寧(tralomethrin)、啞蚱威(triazamate)、三氯松(trichlorfon)、triflumezopyrim、三福隆(triflumuron)、蘇力菌德他內毒素(*Bacillus thuringiensis* delta-endotoxins)、蟲生細菌(entomopathogenic

bacteria)、蟲生病毒(entomopathogenic viruses)以及蟲生真菌(entomopathogenic fungi)。

10. 如請求項 9 之組成物，其中該至少一種額外生物活性化合物或藥劑係選自由下列所組成之群組：阿巴汀、亞滅培、阿納寧、afidopyropen、三亞蹠、阿維菌素、印棟素、免扶克、免速達、畢芬寧、布芬淨、硫線磷、加保利、培丹、剋安勃、克凡派、陶斯松、可尼丁、氰特破、cyclaniliprole、乙氰菊酯(cycloprothrin)、賽扶寧、貝塔賽扶寧、賽洛寧、伽瑪賽洛寧、拉目達賽洛寧、賽滅寧、亞滅寧、傑他賽滅寧、賽滅淨、第滅寧、地特靈、達特南、苯蟲醚、因滅汀、安殺番、益化利、乙蟲清、依芬寧、依殺蟎、撲滅松、芬硫克、芬諾克、芬化利、芬普尼、flometoquin、氟尼胺、氟蟲醯胺、氟芬隆、氟菌蟎酯(flufenoxystrobin)、flufensulfone、flupiprole、弗盧皮拉蒂(flupyradifurone)、福化利、覆滅蟎、福賽絕、氯氟醚菊酯(heptafluthrin)、六伏隆、愛美松、益達胺、因得克、祿芬隆、氯氟醚菊酯、美氟綜、滅賜克、納乃得、美賜平、滅芬諾、美特寧、monofluorothrin、烯啶蟲胺、尼殺賽、諾伐隆、毆殺滅、pyflubumide、派滅淨、除蟲菊精、畢達本、啶蟲丙醚、啞蟎胺、百利普芬、阿諾鹼、賜托拉、賜諾殺、賜派芬、螺甲蟎酯、螺蟲乙酯、賜殺羅、得芬諾、治滅寧、四甲氟菊酯、賽果培、賽速安、硫敵克、殺蟲單、泰滅寧、啞蚜威、triflumezopyrim、三福隆、蘇力菌德他內毒素、所有蘇力菌之品系與所有核多角體病病毒之品系。

11. 一種用於防治一無脊椎動物害蟲的方法，其包含以一生物有效量的如請求項 1 之化合物接觸該無脊椎動物害蟲或其環境。
12. 如請求項 11 之方法，其中該環境為一植物。
13. 如請求項 11 之方法，其中該環境為一動物。
14. 如請求項 11 之方法，其中該環境為一種子。
15. 如請求項 14 之方法，其中該種子係經配製為一組成物的如請求項 1 之化合物塗覆，該組成物包含一成膜劑或黏著劑。
16. 一種經處理之種子，其包含一量為處理前該種子重量之約 0.0001 至 1% 的如請求項 1 之化合物。