

[19] 中华人民共和国国家知识产权局



[12] 发明专利申请公布说明书

[21] 申请号 200810005722.0

[51] Int. Cl.

C07D 213/82 (2006.01)

C07D 401/06 (2006.01)

C07D 413/06 (2006.01)

A01N 43/40 (2006.01)

A01N 43/50 (2006.01)

A01N 43/54 (2006.01)

[43] 公开日 2008 年 7 月 30 日

[11] 公开号 CN 101230038A

[51] Int. Cl. (续)

A01N 43/653 (2006.01)

A01N 43/713 (2006.01)

A01N 43/88 (2006.01)

A01P 7/00 (2006.01)

[22] 申请日 2003.5.6

[21] 申请号 200810005722.0

分案原申请号 03811009.1

[30] 优先权

[32] 2002.5.16 [33] EP [31] 02010910.4

[71] 申请人 拜尔作物科学有限公司

地址 德国法兰克福

[72] 发明人 荒木恒一 村田哲也 郡岛浩志
中仓纪彦 下城英一 C·阿诺德
W·赫姆佩尔 D·詹斯

O·马尔萨姆 J·M·威贝尔

[74] 专利代理机构 中国国际贸易促进委员会专利商
标事务所

代理人 殷 骏

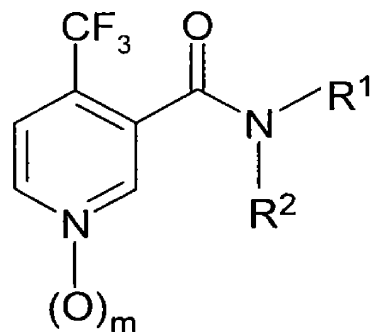
权利要求书 12 页 说明书 117 页

[54] 发明名称

吡啶甲酰胺衍生物及其作为杀虫剂的用途

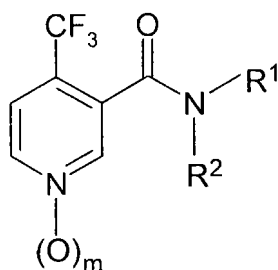
[57] 摘要

本发明涉及式(I)的3-吡啶甲酰胺衍生物(其中各种符号如说明书所定义)、其组合物、其用于控制害虫的用途,并涉及其制备方法。



(I)

1. 式 (I) 化合物或其杀虫可接受的盐,



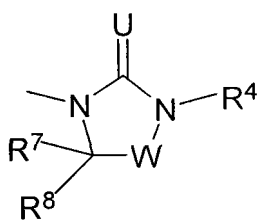
(I)

其中

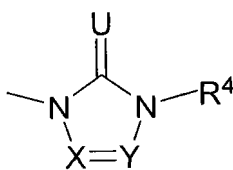
R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$ 或 $-C(=V)OR^{3a}$;

R^2 为 H、 (C_1-C_6) 烷基或 R^3 ;

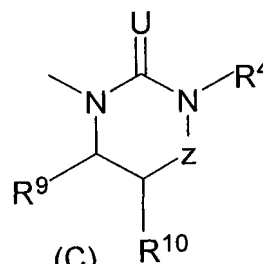
R^3 为 R^5 、OH 或 NH_2 ; 或为由一个或多个 R^6 基团取代的 (C_1-C_6) 烷基; 或 R^2 和 R^3 与连接原子一并形成选自 (A)、(B)、(C)、(D) 和 (E) 的杂环:



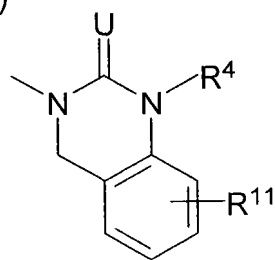
(A)



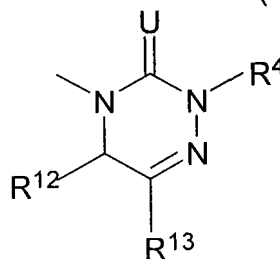
(B)



(C)



(D)



(E)

R^{3a} 为 (C_3-C_8) 环烷基或 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基, 该环烷基是未取代的或由一个或多个 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤烷基或 R^6 基团取代的; 或为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 链烯基或 (C_3-C_6) 炔基, 其中最后三个所

述基团是由一个或多个 R^6 基团取代的；或为 (C_1-C_6) 烷基氨基；或为 $NH(CHR^{14})_s$ 芳基，该芳基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；

R^4 为 H 或 R^5 ；或为未取代或由一个或多个 R^6 基团取代的 (C_1-C_6) 烷基；

或 R^3 和 R^4 与相邻的 N 原子一同形成 3 至 8 元不饱和的或饱和杂环，所述杂环任选地含有多至 3 个其它的 N、O 或 S 原子，以及该环是未取代的或由一个或多个 R^6 或 R^{14a} 基团取代的；

R^5 为 (C_3-C_6) 链烯基、 (C_3-C_6) 炔基、 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 链烯氧基、 (C_3-C_6) 炔氧基、 (C_1-C_6) 烷基氨基、二 (C_1-C_6) 烷基氨基、 $CO(C_1-C_6)$ 烷基、 $NHCO(C_1-C_6)$ 烷基、 $NHSO_2(C_1-C_6)$ 烷基或 $SO_2(C_1-C_6)$ 烷基，其中最后 12 个所述基团是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；或为 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基，该环烷基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；或为 $NH(CHR^{14})_s$ 芳基、 $-(CR^{15}R^{16})_p$ 芳基、 $O(CR^{15}R^{16})_r$ 芳基、 $NHCO$ 芳基、 $CO(CH_2)_t$ 芳基、 $NHSO_2$ 芳基、 $SO_2(CH_2)_u$ 芳基或 $N=C(芳基)_2$ 、 $-(CR^{15}R^{16})_p$ 杂环基或 $O(CR^{15}R^{16})_r$ 杂环基，最后 10 个所述芳基或杂环基是未取代的或由一个或多个 R^{17} 基团取代的；或为 $O(CR^{15}R^{16})_p(C_3-C_8)$ 环烷基或 $N=C[(C_1-C_6)烷基]_2$ ；

R^6 为卤素、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 卤烷氧基、 $S(O)_nR^{14a}$ 、 CN 、 $CO_2(C_1-C_6)$ 烷基、 CO_2H 、 NO_2 、 OH 、氨基、 (C_1-C_6) 烷基氨基、二 (C_1-C_6) 烷基氨基、氨甲酰基、 (C_1-C_6) 烷基氨甲酰基、二 (C_1-C_6) 烷基氨甲酰基或 $CH[O(C_1-C_6)烷基]_2$ ；或为未取代或由一个或多个 R^{14a} 或卤素基团取代的苯氧基；

R^{17} 为 R^6 、 R^{14a} 或 CH_2OH ；

U 为 S、O 或 NR^{18} ；

V 为 O 或 S；

W 为 $(CHR^{19})_q$ 、CO 或 NR^{20} ；

X 为 CR^{21} 或 N；

Y 为 CR^{22} 或 N；

Z 为 O、CO 或 NR^{23} ；

R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{12} 、 R^{19} 、 R^{21} 和 R^{22} 各自为 H；或为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 链烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_2-C_6) 链烯氧基、 (C_2-C_6) 炔氧基，其中最后七个所述基团是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；或为 $-(CH_2)_p$ 芳基或杂环基，其中芳基或杂环基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；或为 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基，其中环烷基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；

或 R^7 和 R^8 一同与所连接的碳原子形成 $C=O$ ；

R^{10} 、 R^{20} 和 R^{23} 各自为 H；或为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 链烯基、 (C_3-C_6) 炔基或 (C_3-C_8) 环烷基，其中最后四个所述基团是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；或为 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基，其中环烷基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；或为 $-(CH_2)_p$ 芳基或杂环基，其中芳基或杂环基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；

R^{11} 为 R^7 、卤素、 CN 、 CO_2 (C_1-C_6) 烷基、 NO_2 或 $S(O)_n R^{14}$ ；或为 (C_1-C_6) 烷基氨基或二 (C_1-C_6) 烷基氨基，该基团是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；

R^{13} 为 R^7 或 OH ；

R^{14} 、 R^{15} 和 R^{16} 各自为 H、 (C_1-C_6) 烷基或 (C_1-C_6) 卤烷基；

R^{14a} 为 (C_1-C_6) 烷基或 (C_1-C_6) 卤烷基；

R^{18} 为 R^7 或 OH ；或为 (C_1-C_6) 烷基氨基或二 (C_1-C_6) 烷基氨基，该基团是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；

m 为 0 或 1；

n 、 p 、 r 、 s 、 t 和 u 各自为 0、1 或 2；

q 为 1、2 或 3；并且上述的每个杂环基团各自为具有 3 至 7 个环原子和 1 至 4 个选自 N、O 和 S 杂原子的杂环基团；

排除其中 R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$ ； U 为 O； R^2 为 H； m 为 0； R^4 为 H 并且 R^3 为 2,4-二氯苯基的化合物。

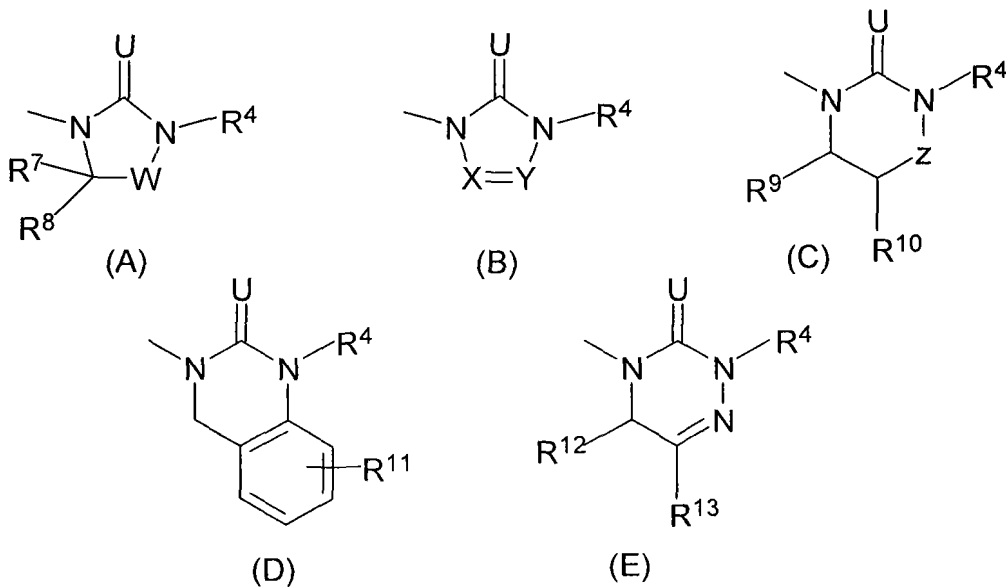
2. 根据权利要求 1 所述的化合物或其杀虫可接受的盐，其特征

在于:

R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$ 或 $-C(=V)OR^{3a}$;

R^2 为 H、 (C_1-C_6) 烷基或 R^3 ;

R^3 为 R^5 、OH 或 NH_2 ; 或为由一个或多个 R^6 基团取代的 (C_1-C_6) 烷基; 或 R^2 和 R^3 与连接原子一并形成选自 (A)、(B)、(C)、(D) 和 (E) 的杂环:



R^{3a} 为 (C_3-C_8) 环烷基或 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基, 该环烷基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的; 或为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 链烯基或 (C_3-C_6) 炔基, 其中最后三个所述基团是由一个或多个 R^6 基团取代的; 或为 (C_1-C_6) 烷基氨基; 或为 $NH(CHR^{14})$, 芳基, 该芳基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的;

R^4 为 H 或 R^5 ; 或为未取代或由一个或多个 R^6 基团取代的 (C_1-C_6) 烷基;

或 R^3 和 R^4 与相邻的 N 原子一同形成 3 至 8 元不饱和的或饱和杂环, 所述杂环任选地含有多至 3 个其它的 N、O 或 S 原子, 以及该环是未取代的或由一个或多个 R^6 或 R^{14a} 基团取代的;

R^5 为 (C_3-C_6) 链烯基、 (C_3-C_6) 炔基、 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 链烯氧基、 (C_3-C_6) 炔氧基、 (C_1-C_6) 烷基氨基、二 (C_1-C_6) 烷基氨基、 $CO(C_1-C_6)$ 烷基、 $NHCO(C_1-C_6)$ 烷基、 $NHSO_2(C_1-C_6)$ 烷基或

$\text{SO}_2(\text{C}_1-\text{C}_6)$ 烷基, 其中最后 12 个所述基团是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的; 或为 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基, 该环烷基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的; 或为 $\text{NH}(\text{CHR}^{14})_s$ 芳基、 $-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})_p$ 芳基、 $\text{O}(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})_r$ 芳基、 NHCO 芳基、 $\text{CO}(\text{CH}_2)_t$ 芳基、 NHSO_2 芳基、 $\text{SO}_2(\text{CH}_2)_u$ 芳基或 $\text{N}=\text{C}(\text{芳基})_2$ 、 $-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})_p$ 杂环基或 $\text{O}(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})_r$ 杂环基, 最后 10 个所述芳基或杂环基是未取代的或由一个或多个 R^{17} 基团取代的; 或为 $\text{O}(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})_p(\text{C}_3-\text{C}_8)$ 环烷基或 $\text{N}=\text{C}[(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{烷基}]_2$;

R^6 为卤素、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 卤烷氧基、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{14a}$ 、 CN 、 $\text{CO}_2(\text{C}_1-\text{C}_6)$ 烷基、 CO_2H 、 NO_2 、 OH 、氨基、 (C_1-C_6) 烷基氨基、二 (C_1-C_6) 烷基氨基、氮甲酰基、 (C_1-C_6) 烷基氮甲酰基、二 (C_1-C_6) 烷基氮甲酰基或 $\text{CH}[\text{O}(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{烷基}]_2$; 或为未取代或由一个或多个 R^{14a} 或卤素基团取代的苯氧基;

R^{17} 为 R^6 、 R^{14a} 或 CH_2OH ;

U 为 S 、 O 或 NR^{18} ;

V 为 O 或 S ;

W 为 $(\text{CHR}^{19})_q$ 、 CO 或 NR^{20} ;

X 为 CR^{21} 或 N ;

Y 为 CR^{22} 或 N ;

Z 为 O 、 CO 或 NR^{23} ;

R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{12} 、 R^{19} 、 R^{21} 和 R^{22} 各自为 H ; 或为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 链烯基、 (C_2-C_6) 炔基、 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_2-C_6) 链烯氧基或 (C_2-C_6) 炔氧基, 其中最后七个所述基团是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的; 或为 $-(\text{CH}_2)_p$ 芳基或杂环基, 其中芳基或杂环基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的; 或为 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基, 其中环烷基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的;

或 R^7 和 R^8 一同与所连接的碳原子形成 $\text{C}=\text{O}$;

R^{10} 、 R^{20} 和 R^{23} 各自为 H ; 或为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 链烯基、 (C_3-C_6) 炔基或 (C_3-C_8) 环烷基, 其中最后四个所述基团是未取代的或由一个或

多个 R^6 基团取代的；或为 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基，其中环烷基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；或为 $-(CH_2)_p$ 芳基或杂环基，其中芳基或杂环基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；

R^{11} 为 R^7 、卤素、CN、 CO_2 (C_1-C_6) 烷基、 NO_2 或 $S(O)_n R^{14}$ ；或为 (C_1-C_6) 烷基氨基或二 (C_1-C_6) 烷基氨基，该基团是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；

R^{13} 为 R^7 或 OH；

R^{14} 、 R^{15} 和 R^{16} 各自为 H、 (C_1-C_6) 烷基或 (C_1-C_6) 卤烷基；

R^{14a} 为 (C_1-C_6) 烷基或 (C_1-C_6) 卤烷基；

R^{18} 为 R^7 或 OH；或为 (C_1-C_6) 烷基氨基或二 (C_1-C_6) 烷基氨基，该基团是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；

m 为 0 或 1；

n 、 p 、 r 、 s 、 t 和 u 各自为 0、1 或 2；

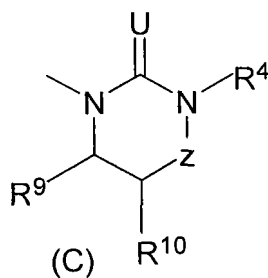
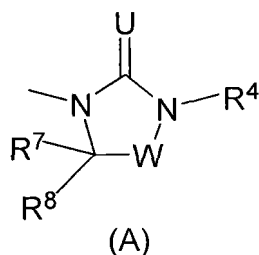
q 为 1、2 或 3；并且上述的每个杂环基团各自为具有 3 至 7 个环原子和 1 至 4 个选自 N、O 和 S 杂原子的杂环基团；

排除其中 R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$ ；U 为 O； R^2 为 H； m 为 0； R^4 为 H 并且 R^3 为 2,4-二氯苯基的化合物。

3. 根据权利要求 1 所述的化合物或其杀虫可接受的盐，其特征在于： R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$ 。

4. 根据权利要求 1 所述的化合物或其杀虫可接受的盐，其特征在于 R^2 为 H 或 R^3 。

5. 根据权利要求 1 所述的化合物或其杀虫可接受的盐，其特征在于： R^3 为 R^5 或 OH；或为由一个或多个 R^6 基团取代的 (C_1-C_6) 烷基；或 R^2 和 R^3 与连接原子一并形成选自 (A) 和 (C) 的杂环：



6. 根据权利要求 1 所述的化合物或其杀虫可接受的盐, 其特征在于: R^4 为 H 或 R^5 ; 或为未取代或由一个或多个 R^6 基团取代的 (C_1-C_6) 烷基;

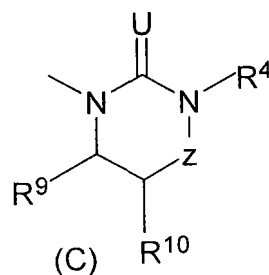
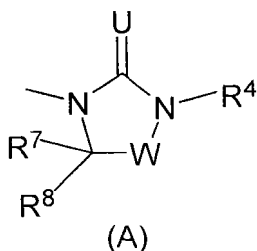
或 R^3 和 R^4 与相邻的 N 原子一同形成 3 至 8 元不饱和的或饱和杂环, 所述杂环任选地含有多至 3 个其它的 N、O 或 S 原子, 以及该环是未取代的或由一个或多个 R^6 或 R^{14a} 基团取代的。

7. 根据权利要求 1 所述的化合物或其杀虫可接受的盐, 其特征在于:

R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$;

R^2 为 H;

R^3 为 R^5 或 OH; 或为由一个或多个 R^6 基团取代的 (C_1-C_6) 烷基; 或 R^2 和 R^3 与连接原子一并形成 (A) 和 (C) 的杂环:



R^4 为 H 或 R^5 ; 或为未取代或由一个或多个 R^6 基团取代的 (C_1-C_6) 烷基;

或 R^3 和 R^4 与相邻的 N 原子可一同形成吡咯烷-1-基、哌啶-1-基、吗啉-1-基或硫代吗啉-1-基环或其 S-氧化物或 S,S-二氧化物

环;

R^5 为 (C_3-C_6) 链烯基、 (C_3-C_6) 炔基、 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 链烯氧基、 (C_3-C_6) 炔氧基或 $O(CR^{15}R^{16})_p(C_3-C_8)$ 环烷基; 或为 $-(CR^{15}R^{16})_p$ 苯基、 $-(CR^{15}R^{16})_p$ 杂环基、 $O(CR^{15}R^{16})_r$ 苯基或 $O(CR^{15}R^{16})_r$ 杂环基, 最后四个所述苯基或杂环基是未取代的或由一个或多个 R^{17} 基团取代的;

R^6 为卤素、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 卤烷氧基、 $S(O)_nR^{14a}$ 、 CN 、 NO_2 或 OH ;

R^{17} 为 R^6 、 R^{14a} 或 CH_2OH ;

U 为 S 或 O ;

W 为 $(CHR^{19})_q$ 或 CO ;

Z 为 O ;

R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 和 R^{19} 各自为 H ; 或为未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的 (C_1-C_6) 烷基;

或 R^7 和 R^8 一同与所连接的碳原子形成 $C=O$;

R^{14} 、 R^{15} 和 R^{16} 各自为 H 或 (C_1-C_6) 烷基

R^{14a} 为 (C_1-C_6) 烷基或 (C_1-C_6) 卤烷基;

m 为 0 ;

n 、 r 、 s 、 t 和 u 为 0 、 1 或 2 ;

q 为 1 ; 并且其中杂环指吡啶、嘧啶、 $(1, 2, 4)$ -噁二唑、 $(1, 3, 4)$ -噁二唑、 $(1, 2, 4)$ -噻二唑、 $(1, 3, 4)$ -噻二唑、吡咯、呋喃、噻吩、噁唑、噻唑、苯并噻唑、咪唑、吡唑、异噁唑、 $1, 2, 4$ -三唑、四唑、吡嗪、哒嗪、噁唑啉、噻唑啉、四氢呋喃、四氢吡喃、吗啉、哌啶、哌嗪、吡咯啉、吡咯烷、噁唑烷、噻唑烷、环氧乙烷、氧杂环丁烷基团。

8. 根据权利要求 1 的化合物或其杀虫可接受的盐, 其特征在于:

R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$;

R^2 为 H ;

U 为 O 或 S;

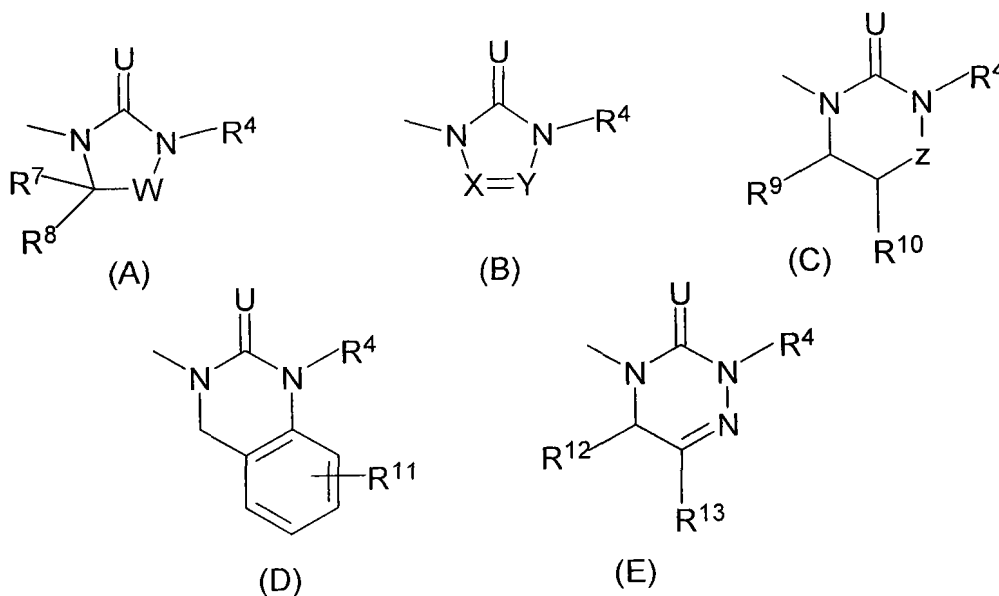
R^3 为 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 卤烷氧基、 (C_3-C_6) 链烯氧基、 (C_3-C_6) 炔氧基、 CH_2 苯基或 OCH_2 苯基、苯基或 2-吡啶基, 其中最后四个所述苯基或吡啶基是未取代的或由一个或多个选自卤素、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、CN 和 NO_2 取代的;

R^4 为 H、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 链烯基、 (C_3-C_6) 炔基或 OCH_2 苯基并且

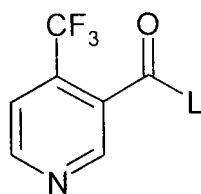
m 为 0。

9. 一种制备权利要求 1 至 8 任一项所述的式 (I) 化合物或其杀虫可接受盐的方法, 其特征在于该方法包含:

a) 当 R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$, m 为 0, 并且 R^2 、U、 R^3 和 R^4 如式 (I) 所定义; 或 R^2 和 R^3 与相连原子一同形成选自 (A)、(B)、(C)、(D) 和 (E) 的杂环:



其中 R^4 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、W、X、Y 和 Z 如式 (I) 所定义, 将式 (II) 化合物:

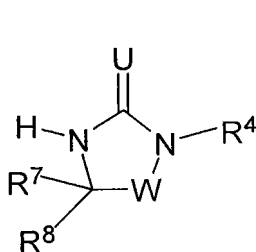


(II)

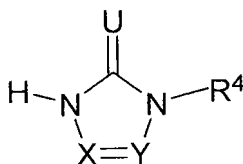
其中 L 为离去基团，与式 (III) 化合物反应：



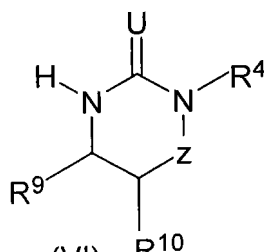
其中 R^2 、U、 R^3 和 R^4 如式 (I) 所定义，或与式 (IV)、(V)、(VI)、(VII) 或 (VIII) 反应：



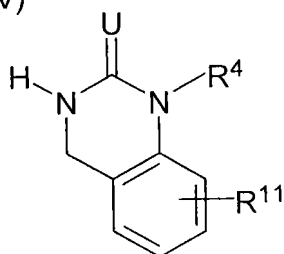
(IV)



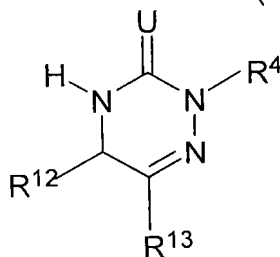
(V)



(VI)



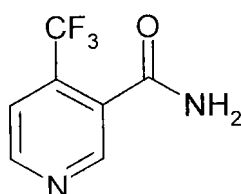
(VII)



(VIII)

其中 R^4 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、W、X、Y 和 Z 如式 (I) 所定义；或

b) 当 R^1 为 $-\text{C}(=\text{U})\text{NR}^3\text{R}^4$ ，m 为 0， R^2 为 H，U 为 O，并且 R^3 和 R^4 如式 (I) 所定义，将式 (IX) 化合物：



(IX)

与草酰氯或三光气反应, 得到相应的酰基异氰酸酯中间体, 随后将其与式 (X) 的胺反应:



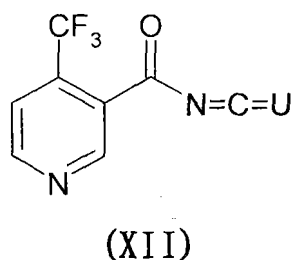
其中 R^3 和 R^4 如式 (I) 所定义; 或

c) 当 R^1 为 $-\text{C}(=\text{V})\text{OR}^{3a}$, m 为 0, R^2 为 H, V 为 O, 并且 R^{3a} 如式 (I) 所定义, 将上述式 (IX) 化合物与草酰氯反应, 得到酰基异氰酸酯中间体, 随后将其与式 (XI) 的醇反应:



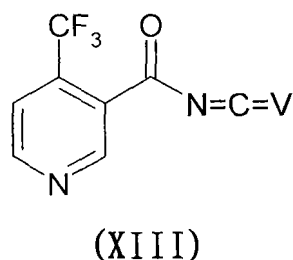
其中 R^3 如式 (I) 所定义; 或

d) 当 R^1 为 $-\text{C}(=\text{U})\text{NR}^3\text{R}^4$, m 为 0, R^2 为 H, U 为 O 或 S, 并且 R^3 和 R^4 如式 (I) 所定义, 将式 (XII) 化合物:



其中 U 为 O 或 S, 与其中 R^3 和 R^4 如权利要求 1 至 8 任一项所定义的式 (X) 化合物反应; 或

e) 当 R^1 为 $-\text{C}(=\text{V})\text{OR}^{3a}$, m 为 0, R^2 为 H, V 为 O 或 S, 并且 R^{3a} 如式 (I) 所定义, 将式 (XIII) 化合物:



其中 V 为 O 或 S, 与上述式 (XI) 化合物反应; 或

f) 当 R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$, m 为 0, R^2 为 H, R^4 为 H, U 为 O 或 S, 并且 R^3 如式 (I) 所定义, 将其中如 b) 方案所定义的式 (IX) 化合物与强碱反应, 随后将其与式 (XIV) 化合物反应:



其中 R^3 如式 (I) 所定义; 或

g) 当 R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$ 或 $-C(=V)OR^{3a}$, m 为 0, R^2 为 H, U 和 V 为 S, 并且 R^3 、 R^{3a} 和 R^4 如式 (I) 所定义, 将 4-三氟甲基烟酸与卤化剂 1-位反应产生相应的酰基氯, 随后将其与碱金属硫代氰酸盐或硫代氰酸铵或硫代氰酸四烷基铵反应, 得到 4-三氟甲基-3-吡啶基羰基异硫代氰酸酯, 随后将其与上述式 (X) 的胺或上述式 (XI) 的醇反应; 或

h) 当 R^1 和 R^2 如权利要求 1 至 8 任一项所定义, 并且 m 为 1, 将其中 m 为 0 的相应的化合物进行氧化反应。

10. 根据权利要求 9 的方法, 将所得式 (I) 化合物转化成其杀虫可接受的盐。

11. 一种含有权利要求 1 至 8 任一所定义的式 (I) 化合物或其杀虫可接受的盐, 与杀虫可接受的稀释剂或载体和/或表面活性剂相结合的杀虫组合物。

12. 权利要求 1 至 8 任一所定义的式 (I) 化合物或其杀虫可接受的盐用作杀虫剂的用途。

吡啶甲酰胺衍生物及其作为杀虫剂的用途

本发明涉及 3-吡啶甲酰胺衍生物及其用于控制害虫，尤其是节肢动物如昆虫和螨类，以及蠕虫(包括线虫)的用途；本发明还涉及包含该化合物的组合物，以及制备该化合物的方法和中间体。

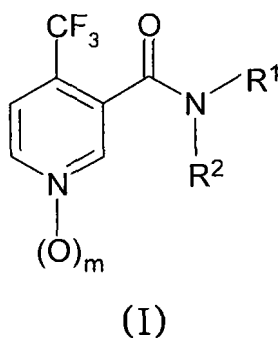
利用 3-吡啶甲酰胺化合物控制昆虫、线虫或蠕虫已在许多专利中公开了，如 EP 580374、JP 10101648、JP 10182625、W0 200109104、W0 200114340、JP 6321903、JP10195072 和 JP 11180957。

然而在所有应用领域中，这些现有化合物的活性水平和/或活性持久性不能完全令人满意，尤其是防治某些生物或当低浓度施用。

由于现代杀虫剂必须满足广泛的需求，例如有关活性水平、持久性以及作用谱、使用谱、毒性、与其它活性物质的组合、与助剂的组合或合成，以及可能出现的抗药性，这类物质的开发永远不能终止，目前对于优于已知化合物的新化合物(至少对所关注的某些方面来说)有持续的大量需求。

本发明的一个目的是提供在各方面扩大杀虫谱的化合物。

本发明提供的化合物为式(I)所示的 3-吡啶甲酰胺衍生物：

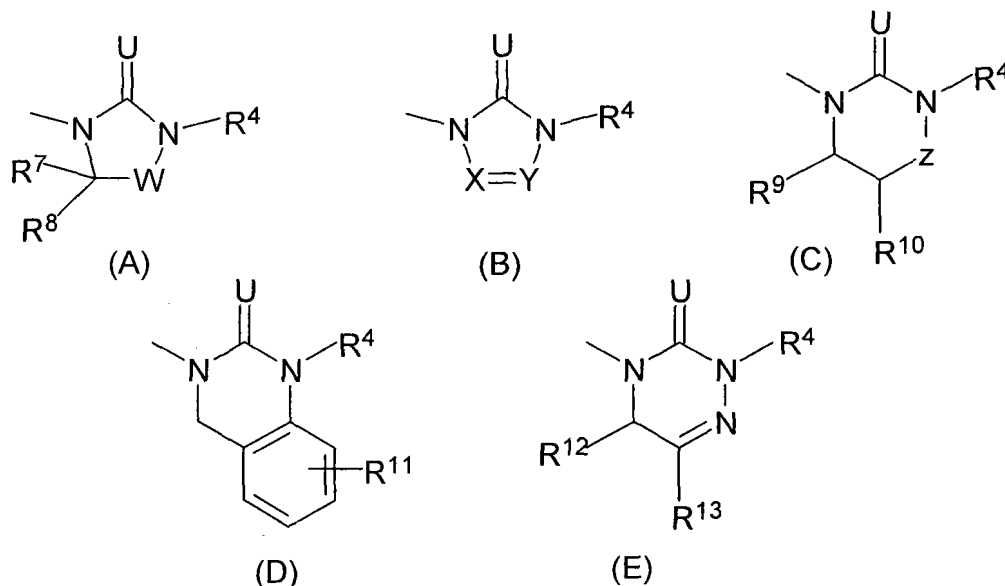


其中：

R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$ 或 $-C(=V)OR^{3a}$ ；

R^2 为 H、 (C_1-C_6) 烷基或 R^3 ；

R^3 为 R^5 、OH 或 NH_2 ；或为由一个或多个 R^6 基团取代的 (C_1-C_6) 烷基；或 R^2 和 R^3 与连接原子一并形成选自 (A)、(B)、(C)、(D) 和 (E) 的杂环：



R^{3a} 为 (C_3-C_8) 环烷基或 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基，该环烷基是未取代的或由一个或多个 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤烷基或 R^6 基团取代的；或为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 链烯基或 (C_3-C_6) 炔基，其中最后三个所述基团是由一个或多个 R^6 基团取代的；或为 (C_1-C_6) 烷基氨基；或为未取代或由一个或多个 R^6 基团取代的 $NH(CHR^{14})$ ，芳基；

R^4 为 H 或 R^5 ；或为未取代或由一个或多个 R^6 基团取代的 (C_1-C_6) 烷基；

或 R^3 和 R^4 与相邻的 N 原子一同形成 3 至 8 元不饱和的、部分饱和的或饱和杂环，所述杂环任选地含有多至 3 个其它的 N、O 或 S 原子，以及该环是未取代的或由一个或多个 R^6 或 R^{14a} 基团取代的（这类环系的优选实例包括吡咯烷-1-基、吡咯啉-1-基、哌啶-1-基、吗啉-1-基（或其 N-氧化物）、硫代吗啉-1-基（或其 S-氧化物或 S, S-二氧化物）、4, 5-二氢吡唑-1-基、或吡唑-1-基）；

R^5 为 (C_3-C_6) 链烯基、 (C_3-C_6) 炔基、 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 链烯氧基、 (C_3-C_6) 炔氧基、 (C_1-C_6) 烷基氨基、二 (C_1-C_6) 烷基氨基、 $CO(C_1-C_6)$ 烷基、 $NHCO(C_1-C_6)$ 烷基、 $NHSO_2(C_1-C_6)$ 烷基或

$\text{SO}_2(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基, 其中最后 12 个所述基团是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的; 或为 $(\text{C}_3\text{-C}_8)$ 环烷基- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基, 该环烷基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的; 或为 $\text{NH}(\text{CHR}^{14})_s$ 芳基、 $-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})_p$ 芳基、 $\text{O}(\text{R}^{15}\text{R}^{16})_r$ 芳基、 NHCO 芳基、 $\text{CO}(\text{CH}_2)_t$ 芳基、 NHSO_2 芳基、 $\text{SO}_2(\text{CH}_2)_u$ 芳基或 $\text{N}=\text{C}(\text{芳基})_2$ 、 $-(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})_p$ 杂环基或 $\text{O}(\text{R}^{15}\text{R}^{16})_r$ 杂环基, 最后 10 个所述芳基或杂环基是未取代的或由一个或多个 R^{17} 基团取代的; 或为 $\text{O}(\text{CR}^{15}\text{R}^{16})_p(\text{C}_3\text{-C}_8)$ 环烷基或 $\text{N}=\text{C}[(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{烷基}]_2$;

R^6 为卤素、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷氧基、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 卤烷氧基、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}^{14a}$ 、 CN 、 $\text{CO}_2(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基、 CO_2H 、 NO_2 、 OH 、氨基、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基氨基、二 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基氨基、氮甲酰基、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基氮甲酰基、二 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基氮甲酰基或 $\text{CH}[\text{O}(\text{C}_1\text{-C}_6)\text{烷基}]_2$; 或为未取代或由一个或多个 R^{14a} 或卤素基团取代的苯氧基;

R^{17} 为 R^6 、 R^{14a} 或 CH_2OH ;

U 为 S 、 O 或 NR^{18} ;

V 为 O 或 S ;

W 为 $(\text{CHR}^{19})_q$ 、 CO 或 NR^{20} ;

X 为 CR^{21} 或 N ;

Y 为 CR^{22} 或 N ;

Z 为 O 、 CO 或 NR^{23} ;

R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{12} 、 R^{19} 、 R^{21} 和 R^{22} 各自为 H ; 或为 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基、 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$ 链烯基、 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$ 炔基、 $(\text{C}_3\text{-C}_8)$ 环烷基、 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷氧基、 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$ 链烯氧基、 $(\text{C}_2\text{-C}_6)$ 炔氧基, 其中最后七个所述基团是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的; 或为 $-(\text{CH}_2)_p$ 芳基或杂环基, 其中芳基或杂环基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的; 或为 $(\text{C}_3\text{-C}_8)$ 环烷基- $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基, 其中环烷基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的;

或 R^7 和 R^8 一同与所连接的碳原子可形成 $\text{C}=\text{O}$;

R^{10} 、 R^{20} 和 R^{23} 各自为 H ; 或为 $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 烷基、 $(\text{C}_3\text{-C}_6)$ 链烯基、 $(\text{C}_3\text{-C}_6)$ 炔基或 $(\text{C}_3\text{-C}_8)$ 环烷基, 其中最后四个所述基团是未取代的或由一个或

多个 R^6 基团取代的；或为 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基，其中环烷基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；或为 $-(CH_2)_p$ 芳基或杂环基，其中芳基或杂环基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；

R^{11} 为 R^7 、卤素、CN、 $CO_2(C_1-C_6)$ 烷基、 NO_2 或 $S(O)_nR^{14}$ ；或为 (C_1-C_6) 烷基氨基或二 (C_1-C_6) 烷基氨基，该基团是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；

R^{13} 为 R^7 或 OH；

R^{14} 、 R^{15} 和 R^{16} 各自为 H、 (C_1-C_6) 烷基或 (C_1-C_6) 卤烷基；

R^{14a} 为 (C_1-C_6) 烷基或 (C_1-C_6) 卤烷基；

R^{18} 为 R^7 或 OH；或为 (C_1-C_6) 烷基氨基或二 (C_1-C_6) 烷基氨基，该基团是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；

m 为 0 或 1；

n 、 p 、 r 、 s 、 t 和 u 各自为 0、1 或 2；

q 为 1、2 或 3；并且上述的每个杂环基团各自为具有 3 至 7 个环原子和 1 至 4 个选自 N、O 和 S 杂原子的杂环基团；

或其杀虫可接受的盐；

排除其中 R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$ ； U 为 O； R^2 为 H； m 为 0； R^4 为 H 并且 R^3 为 2,4-二氯苯基的化合物。

这些化合物具颇有价值的杀虫特性。

本发明还包括上述化合物的任何立体异构体、对映异构体或几何异构体，以及它们的混合物。

术语“杀虫可接受的盐”指这样的一类盐，其阳离子或阴离子是已知的、并且在本领域用于形成用作杀虫用途的可接受的盐类。适宜的具碱基的盐类，例如通过含羧基或 OH 基团的式 (I) 化合物所形成的，包括碱金属（如钠和钾）、碱土金属（如钙和镁）、铵和胺（如二乙醇胺、三乙醇胺、辛胺、吗啉和二辛基甲胺）的盐类，适宜的酸加成盐，如通过含氨基的式 (I) 化合物形成的盐，包括与无机酸形成的盐，例如盐酸盐、硫酸盐、磷酸盐和硝酸盐以及与有机酸如乙酸形成的盐。

术语“害虫”指节肢动物害虫（包括昆虫和螨类）和蠕虫（包括线虫）。

在本发明的说明书中，包括所附的权利要求书中，上述的取代基具有如下含义：

卤素指氟、氯、溴或碘；

烷基和烷基部分（除非另外定义）为直链或支链；

环烷基优选在环上具有 3 至 6 个碳原子，并且任选由卤素或烷基取代。

卤烷基和卤烷氧基团可连有一个或多个卤素原子；这类优选的基团包括 $-\text{CF}_3$ 和 $-\text{OCF}_3$ 。

在基团名称前的术语“卤”指该基团部分或完全被卤代，也就是说，以任何组合由 F、Cl、Br 或 I 取代，优选由 F 或 Cl 取代。

表达式“(C₁-C₆)烷基”应理解为具有 1、2、3、4、5 或 6 个碳原子的直链或支链烃基，如甲基、乙基、丙基、异丙基、1-丁基、2-丁基、2-甲基丙基或叔丁基。

“(C₁-C₆)卤烷基”应理解为在所述表达式“(C₁-C₆)烷基”中，一个或多个氢原子被相同数量的相同或不同卤素原子所取代的烷基，优选被氯或氟取代，例如三氟甲基、1-氟乙基、2,2,2-三氟乙基、氯甲基、氟甲基、二氟甲基或 1,1,2,2-四氟乙基。

“(C₁-C₆)烷氧基”应理解为其烃基具有上述表达式“(C₁-C₆)烷基”含义的烷氧基。

具有作为前缀的具一定范围碳原子数的术语“链烯基”和“炔基”指具有与所示范围一致碳原子数的直链和支链烃基，并且含有至少一个可位于各自不饱和基团任何位置的重键。“(C₂-C₆)链烯基”相应地指，例如乙烯基、烯丙基、2-甲基-2-丙烯基、2-丁烯基、戊烯基、2-甲基戊烯基或己烯基。“(C₂-C₆)炔基”指，例如乙炔基、炔丙基、2-甲基-2-丙炔基、2-丁炔基、2-戊炔基或 2-己炔基。

“(C₃-C₈)环烷基”指单环烷基，例如环丙基、环丁基、环戊基、环己基、环庚基或环辛基，并且指双环烷基如降冰片基（norbornyl）

radical)。

表达式“(C₃-C₈)-环烷基-(C₁-C₆)烷基”应理解为这样的基团，例如环丙基甲基、环戊基甲基、环己基甲基、环己基乙基、环己基丁基、1-甲基环丙基、1-甲基环戊基、1-甲基环己基、3-己基环丁基或4-叔丁基环己基。

“(C₁-C₆)烷基氨基”指由上述定义的烷基取代的氮原子。“二(C₁-C₆)烷基氨基”指由上述定义的两个烷基取代的氮原子。

表达式“(C₁-C₆)烷基氨甲酰基”指具有一个表达式“(C₁-C₆)烷基”中所定义的烃基的氨甲酰基；并且“二(C₁-C₆)烷基氨甲酰基”指具有两个可相同或不同烃基的氨甲酰基。

表达式“芳基”应理解为碳环的，即由碳原子构成的，优选具6至14，尤其是6至12个碳原子的芳族基团，例如苯基、萘基或联苯基，优选苯基。

表达式“杂环基”优选指可完全饱和、部分不饱和或完全不饱和，以及环上含有一个或多个相同或不同选自氮、硫和氧原子的环状基团，然而其中两个氧原子不能直接相连并且环上至少有一个碳原子，例如噻吩、呋喃、吡咯、噻唑、噁唑、咪唑、异噻唑、异噁唑、吡唑、1,3,4-噁二唑、1,3,4-噻二唑、1,3,4-三唑、1,2,4-噁二唑、1,2,4-噻二唑、1,2,4-三唑、1,2,3-三唑、1,2,3,4-四唑、苯并[b]噻吩、苯并[b]呋喃、吲哚、苯并[c]噻吩、苯并[c]呋喃、异吲哚、苯并噁唑、苯并噻唑、苯并咪唑、苯并异噁唑、苯并异噻唑、苯并吡唑、苯并噻二唑、苯并三唑、二苯并呋喃、二苯并噻吩、呋唑、吡啶、吡嗪、嘧啶、哒嗪、1,3,5-三嗪、1,2,4-三嗪、1,2,4,5-四嗪、喹啉、异喹啉、喹喔啉、喹唑啉、噌啉、1,8-萘啶、1,5-萘啶、1,6-萘啶、1,7-萘啶、酞嗪、吡啶并嘧啶、嘌呤、蝶啶、4H-喹嗪、哌啶、吡咯烷、噁唑啉、四氢呋喃、四氢吡喃、异噁唑啉、噻唑烷、环氧乙烷或氧杂环丁烷基团。

杂环基优选指饱和、部分饱和或具有3至7个环原子和1至4个选自O、S和N杂原子的芳族环系，其中环上至少有一个碳原子。

更优选地, 杂环基指吡啶、嘧啶、(1, 2, 4)-噁二唑、(1, 3, 4)-噁二唑、(1, 3, 4)-噻二唑、(1, 2, 4)-噻二唑、吡咯、呋喃、噻吩、噁唑、噻唑、苯并噻唑、咪唑、吡唑、异噁唑、1, 2, 4-三唑、四唑、嘧啶、吡嗪、哒嗪、噁唑啉、噻唑啉、四氢呋喃、四氢吡喃、吗啉、哌啶、哌嗪、吡咯啉、吡咯烷、噁唑烷或噻唑烷基团(优选吡啶、嘧啶、(1, 2, 4)-噁二唑、(1, 3, 4)-噁二唑、(1, 3, 4)-噻二唑、(1, 2, 4)-噻二唑、噁唑、吡唑、吡咯、异噁唑、苯并噻唑、1, 2, 4-三唑、吡嗪、哒嗪、环氧乙烷或氧杂环丁烷)。

各种脂肪族、芳族和杂环系优选的取代基包括卤素、硝基、氰基、(C₁-C₄)-烷基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-烷硫基、(C₁-C₄)-烷基亚磺酰基、(C₁-C₄)-烷基磺酰基、苯基、苄基和苯氧基, 其中在烷基和衍生于烷基的基团的一个或多个(并且在氟的情形下多达最大数)的氢原子可由卤素, 优选氯或氟所取代。

更优选的取代基包括卤素、硝基、氰基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤烷基、(C₃-C₆)-环烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤烷氧基、(C₁-C₄)-烷硫基和(C₁-C₄)-卤烷硫基。

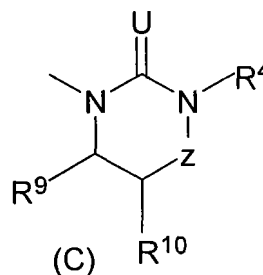
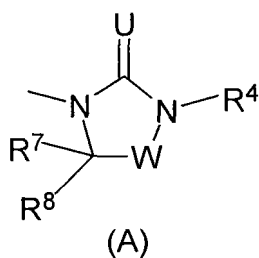
最优选的取代基包括卤素、硝基、氰基、(C₁-C₄)-烷基、(C₁-C₄)-卤烷基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₁-C₄)-卤烷氧基、(C₁-C₄)-烷硫基和(C₁-C₄)-卤烷硫基。

除非另有说明, 通常术语“未取代或由一个或多个基团取代”或“未取代或由一个或多个选自...的基团取代”应理解为这类基团(或优选基团)可相同或不同。

R¹ 优选为 -C(=U)NR³R⁴;

R² 优选为 H、或 R³ (更优选 R² 为 H);

R³ 优选为 R⁵ 或 OH; 或为由一个或多个 R⁶ 基团取代的(C₁-C₆)烷基; 或优选 R² 和 R³ 与连接原子一并形成选自(A)和(C)的杂环:



R^4 优选为 H 或 R^5 ；或为未取代或由一个或多个 R^6 基团取代的 (C_1 - C_6) 烷基；

或 R^3 和 R^4 与相邻的 N 原子一同形成 3 至 8 元不饱和的、部分饱和的或饱和杂环，所述杂环任选地含有多至 3 个其它的 N、O 或 S 原子，以及该环是未取代的或由一个或多个 R^6 或 R^{14a} 基团取代的（这类环系的优选实例包括吡咯-1-基、哌啶-1-基、吗啉-1-基、硫代吗啉-1-基或其 S-氧化物或 S, S-二氧化物；

R^5 优选为 (C_3 - C_6) 链烯基、(C_3 - C_6) 炔基、(C_3 - C_8) 环烷基、(C_3 - C_8) 环烷基- (C_1 - C_6) 烷基、(C_1 - C_6) 烷氧基、(C_3 - C_6) 链烯氧基、(C_3 - C_6) 炔氧基或 $O(CR^{15}R^{16})_p$ (C_3 - C_8) 环烷基；或为 $-(CR^{15}R^{16})_p$ 苯基、 $-(CR^{15}R^{16})_p$ 杂环基、 $O(CR^{15}R^{16})_r$ 苯基或 $O(CR^{15}R^{16})_r$ 杂环基，其中最后四个所述苯基或杂环基是未取代的或由一个或多个 R^{17} 基团取代的；（更优选 R^5 为 (C_3 - C_6) 链烯基、(C_3 - C_6) 炔基、(C_1 - C_6) 烷氧基、(C_3 - C_6) 链烯氧基、(C_3 - C_6) 炔氧基或 $O(CR^{15}R^{16})_p$ (C_3 - C_8) 环烷基；或为 $-(CR^{15}R^{16})_p$ 苯基、 $-(CR^{15}R^{16})_p$ 杂环基、 $O(CR^{15}R^{16})_r$ 苯基或 $O(CR^{15}R^{16})_r$ 杂环基，其中最后四个所述苯基或杂环基是未取代的或由一个或多个 R^{17} 基团取代的)；

R^6 优选为卤素、(C_1 - C_6) 烷氧基、(C_1 - C_6) 卤烷氧基、 $S(O)_nR^{14a}$ 、CN、 NO_2 或 OH；（更优选 R^6 为卤素或 CN）；

R^{17} 优选为 R^6 、 R^{14a} 或 CH_2OH ；

U 优选为 S 或 O；

W 优选为 $(CHR^{19})_q$ 或 CO；

Z 优选为 O；

R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 和 R^{19} 各自优选为 H；或未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的 (C_1 - C_6) 烷基；

或 R^7 和 R^8 一同与所连接的碳原子形成 $C=O$;

R^{14} 、 R^{15} 和 R^{16} 各自优选为 H 或 (C_1-C_6) 烷基;

R^{14a} 优选为 (C_1-C_6) 烷基或 (C_1-C_6) 卤烷基;

m 优选为 0;

n 、 r 、 s 、 t 和 u 优选为 0 或 1;

q 优选为 1; 以及

杂环基优选指吡啶、嘧啶、(1, 2, 4)-噁二唑、(1, 3, 4)-噁二唑、(1, 2, 4)-噻二唑、(1, 3, 4)-噻二唑、苯并噻唑、吡咯、咪唑、噻吩、噁唑、噻唑、咪唑、吡唑、异噁唑、1, 2, 4-三唑、四唑、嘧啶、吡嗪、哒嗪、噁唑啉、噻唑啉、四氢咪唑、四氢吡唑、吗啉、哌啶、哌嗪、吡咯啉、吡咯烷、噁唑烷、噻唑烷、环氧乙烷或氧杂环丁烷基团。

优选的式 (I) 化合物类是这样的化合物, 其中:

R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$ 或 $-C(=V)OR^{3a}$;

R^{3a} 为 (C_3-C_8) 环烷基或 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基, 该环烷基是未取代的或由一个或多个 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤烷基或 R^6 基团取代的; 或为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 链烯基或 (C_3-C_6) 炔基, 其中最后三个所述基团是由一个或多个 R^{6a} 基团取代的; 或为 (C_1-C_6) 烷基氨基; 或为未取代或由一个或多个 R^6 基团取代的 $NH(CHR^{14})$, 芳基;

R^{6a} 为 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 卤烷氧基、 $S(O)_nR^{14a}$ 、 $CO_2(C_1-C_6)$ 烷基、 CO_2H 、氨基、 (C_1-C_6) 烷基氨基、氨基甲酰基、 (C_1-C_6) -烷基氨基甲酰基、二 (C_1-C_6) 烷基氨基甲酰基或 $CH[O(C_1-C_6)烷基]_2$; 或为未取代或由一个或多个 R^{14a} 或卤素基团取代的苯氧基;

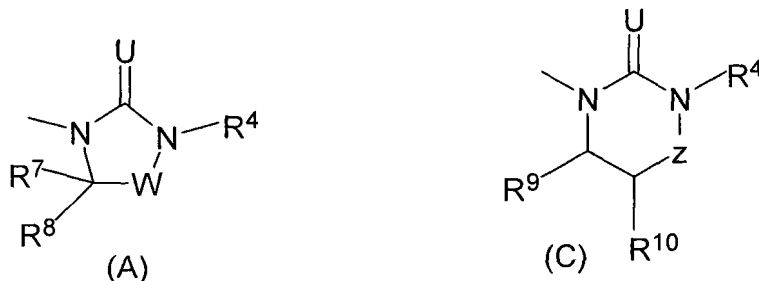
以及其它符号如式 (I) 所定义。

更优选的式 (I) 化合物类是这样的化合物, 其中:

R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$;

R^2 为 H;

R^3 为 R^5 或 OH; 或为由一个或多个 R^6 基团取代的 (C_1-C_6) 烷基; 或 R^2 和 R^3 与连接原子一并形成 (A) 和 (C) 杂环:



R^4 为 H 或 R^5 ; 或为未取代或由一个或多个 R^6 基团取代的 (C_1-C_6) 烷基;

或 R^3 和 R^4 与相邻的 N 原子一同形成吡咯烷-1-基、哌啶-1-基、吗啉-1-基或硫代吗啉-1-基 (或其 S-氧化物或 S, S-二氧化物) 环;

R^5 为 (C_3-C_6) 链烯基、 (C_3-C_6) 炔基、 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_3-C_6) 链烯氧基、 (C_3-C_6) 炔氧基或 $O(CR^{15}R^{16})_p(C_3-C_8)$ 环烷基; 或 $-(CR^{15}R^{16})_p$ 苯基、 $-(CR^{15}R^{16})_p$ 杂环基、 $O(CR^{15}R^{16})_r$ 苯基或 $O(CR^{15}R^{16})_r$ 杂环基, 最后四个所述芳基或杂环基是未取代的或由一个或多个 R^{17} 基团取代的;

R^6 为卤素、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 卤烷氧基、 $S(O)_nR^{14a}$ 、CN、 NO_2 或 OH;

R^{17} 为 R^6 、 R^{14a} 或 CO_2OH ;

U 为 S 或 O;

W 为 $(CHR^{19})_q$ 或 CO;

Z 为 O;

R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 和 R^{19} 各自为 H; 或为未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的; (C_1-C_6) 烷基;

或 R^7 和 R^8 一同与所连接的碳原子形成 $C=O$;

R^{14} 、 R^{15} 和 R^{16} 各自为 H 或 (C_1-C_6) 烷基;

R^{14a} 为 (C_1-C_6) 烷基或 (C_1-C_6) 卤烷基;

m 为 0;

n、r、s、t 和 u 为 0、1 或 2;

q 为 1; 并且其中杂环指吡啶、嘧啶、(1, 2, 4) - 噁二唑、(1, 3, 4) - 噁二唑、(1, 2, 4) - 噻二唑、(1, 3, 4) - 噻二唑、吡咯、呋喃、噻吩、噁唑、噻唑、苯并噻唑、咪唑、吡唑、异噁唑、1, 2, 4-三唑、四唑、吡嗪、哒嗪、噁唑啉、噻唑啉、四氢呋喃、四氢吡喃、吗啉、哌啶、哌嗪、吡咯啉、吡咯烷、噁唑烷、噻唑烷、环氧乙烷或氧杂环丁烷基团。

更优选的式 (I) 化合物类是这样的化合物, 其中:

R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$;

R^2 为 H;

U 为 O 或 S;

R^3 为 (C_1-C_6) 卤烷基、 (C_3-C_6) 链烯基、 (C_3-C_6) 炔基、 (C_3-C_8) 环烷基、 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 链烯氧基、 (C_3-C_6) 炔氧基、 NH_2 、 (C_1-C_6) 烷基氨基、OH、O-苯基、嘧啶基、苯并噻唑基、噻唑基、噻二唑基、 $-(CH_2)_2$ 吡咯-1-基、 $NHSO_2$ 苯基、 $NHCO(C_1-C_6)$ 烷基、 $NHSO_2(C_1-C_6)$ 烷基、 $NHCO$ 苯基或 $N=C(苯基)_2$; 或为未取代或由一个或多个选自卤素、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、CN 和 NO_2 取代的吡啶基; 或为 OCH_2 苯基, 所述苯基是未取代或由一个或多个卤素、 (C_1-C_6) 烷基、CN 和 NO_2 取代的; 或为未取代或由 $CO_2(C_1-C_6)$ 烷基取代的 (C_1-C_6) 烷氧基;

或为 $-(CHR^{15})_p$ 苯基, 其中 p 为 0、1 或 2, R^{15} 为 H 或 (C_1-C_6) 烷基, 并且苯基是未取代的或由一个或多个选自下组基团取代的苯基: 卤素、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 卤烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 卤烷氧基、CN、 NO_2 、OH、 CH_2OH 、 $CO_2(C_1-C_6)$ 烷基和苯氧基, 所述苯氧基是未取代的或由一个或多个卤素或 (C_1-C_6) 卤烷基取代的;

或为未取代或由一个或多个选自下组基团取代的 (C_1-C_6) 烷基: (C_1-C_6) 烷氧基、CN、OH、 $CO_2(C_1-C_6)$ 烷基和 $CH[O(C_1-C_6)烷基]_2$;

或为 $NH(CH_2)_s$ 苯基, 其中 s 为 0 或 1;

R^4 为 H、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 链烯基、 (C_3-C_6) 炔基、 (C_3-C_8) 环烷基、 $-(CH_2)_p$ 苯基, 其中 p 为 0 或 1, 或为 $N=C[(C_1-C_6) \text{ 烷基}]_2$;

或 R^3 和 R^4 与相邻的 N 原子一同形成吡咯烷-1-基、哌啶-1-基、吗啉-1-基、硫代吗啉-1-基, 该基团是未取代的或由一个或多个选自卤素、 (C_1-C_6) 烷基和 OH 取代的; 或形成 4,5-二氢吡唑-1-基环; 且 m 为 0。

更优选的式 (I) 化合物类是这样的化合物, 其中:

R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$;

U 为 O;

R^2 为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 链烯基、 (C_3-C_6) 炔基或 CH_2 苯基; 或为 $CO_2(C_1-C_6)$ 烷基或 $CH[O(C_1-C_6) \text{ 烷基}]_2$ 取代的 (C_1-C_6) 烷基;

R^3 为 (C_3-C_6) 链烯氧基、 (C_3-C_6) 炔氧基、 CH_2 苯基或 OCH_2 苯基; 或为未取代的或由一个或两个 $CO_2(C_1-C_6)$ 烷基取代的 (C_1-C_6) 烷氧基;

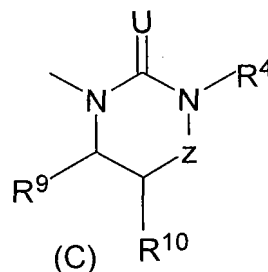
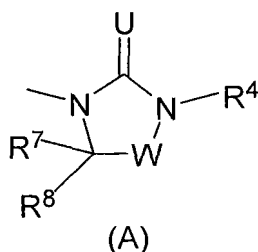
R^4 为 H 或 (C_1-C_6) 烷基; 和

m 为 0。

更优选的式 (I) 化合物类是这样的化合物, 其中:

R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$;

R^2 和 R^3 与相连原子一并形成选自 (A) 和 (C) 的杂环:



其中 U 为 O 或 S;

并且在 (A) 中:

W 为 CH_2 、CO 或 CHR^{19} , 其中 R^{19} 为 H、 (C_1-C_6) 烷基或苯基;

R^4 为 H、 (C_1-C_6) 烷基、苯基、 CH_2 苯基或 OCH_2 苯基；

R^7 为 H、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基或苯基；并且

R^8 为 H 或 (C_1-C_6) 烷基；

并在 (C) 中：

Z 为 O；

R^4 为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_8) 环烷基或 CH_2 苯基；和

R^9 和 R^{10} 各自为 H；并且

m 为 0。

更优选的式 (I) 化合物类是这样的化合物，其中：

R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$ ；

其中 U 为 NR^{18} ；

R^2 为 H；

R^3 为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 链烯基、 (C_3-C_8) 环烷基；或为由一个或两个 (C_1-C_6) 烷氧基或 $CH[O(C_1-C_6)烷基]_2$ 取代的 (C_1-C_6) 烷基；

R^4 和 R^{18} 各自为相同或不同的 H 或 (C_1-C_6) 烷基；

或 R^3 和 R^4 与相邻 N 原子一并形成吗啉-1-基或吡唑-1-基环；并且

m 为 0。

更优选的式 (I) 化合物类是这样的化合物，其中：

R^1 为 $-C(=V)OR^{3a}$ ；

其中 V 为 O 或 S；

R^2 为 H、 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基、 $NHCH_2$ 苯基；或为由一个选自 (C_1-C_6) 烷氧基、CN、OH 和 $S(O)_nR^{14a}$ 基团取代的 (C_1-C_6) 烷基；

R^{3a} 为 (C_3-C_8) 环烷基或 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基，该环烷基是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；或为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 链烯基或 (C_3-C_6) 炔基，其中最后三个所述基团是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的；或为 (C_1-C_6) 烷基氨基；或为未取代或由一个或多个

个 R^6 基团取代的 $NH(CHR^{14})_s$ 芳基；并且
 m 为 0。

更优选的式 (I) 化合物类是这样的化合物，其中：

R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$ ；

R^2 为 H；

U 为 O 或 S；

R^3 为 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 卤烷氧基、 (C_3-C_6) 链烯氧基、 (C_3-C_6) 炔氧基、 CH_2 苯基或 OCH_2 苯基、苯基或 2-吡啶基，其中最后四个所述苯基或吡啶基是未取代的或由一个或多个选自卤素、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、CN 和 NO_2 取代的；

R^4 为 H、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 链烯基、 (C_3-C_6) 炔基或 CH_2 苯基；
并且

m 为 0。

更优选的式 (I) 化合物类是这样的化合物，其中：

R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$ ；

R^2 为 H；

U 为 O；

R^3 为 (C_1-C_6) 烷氧基；

R^4 为 (C_1-C_6) 烷基；并且

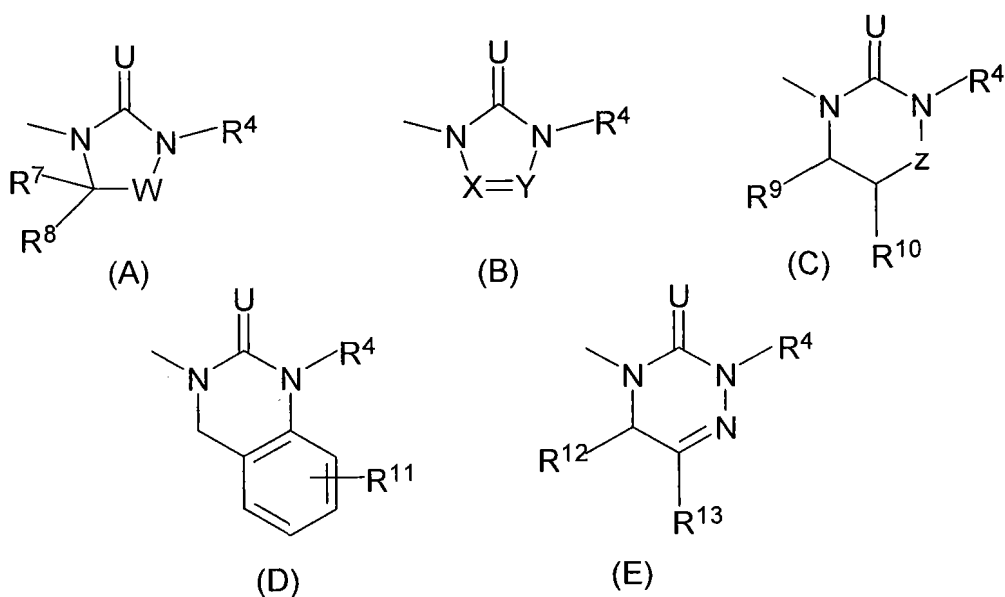
m 为 0。

通式 (I) 化合物可通过本申请或改进的已知方法加以制备（即迄今为止在化学文献中所采用的或描述的方法）。

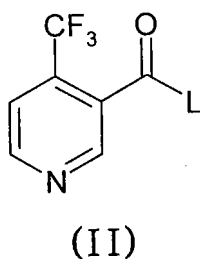
在如下的方法描述中，当没有对式中所出现的符号进行特别定义时，“如上所定义”应理解为根据说明书中对每个符号的首次说明。

根据本发明式 (I) 化合物的特征，其中： R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$ ， m 为 0，并且 R^2 、U、 R^3 和 R^4 如上所定义；或 R^2 和 R^3 与相连原子一同形

成选自 (A)、(B)、(C)、(D) 和 (E) 的杂环;



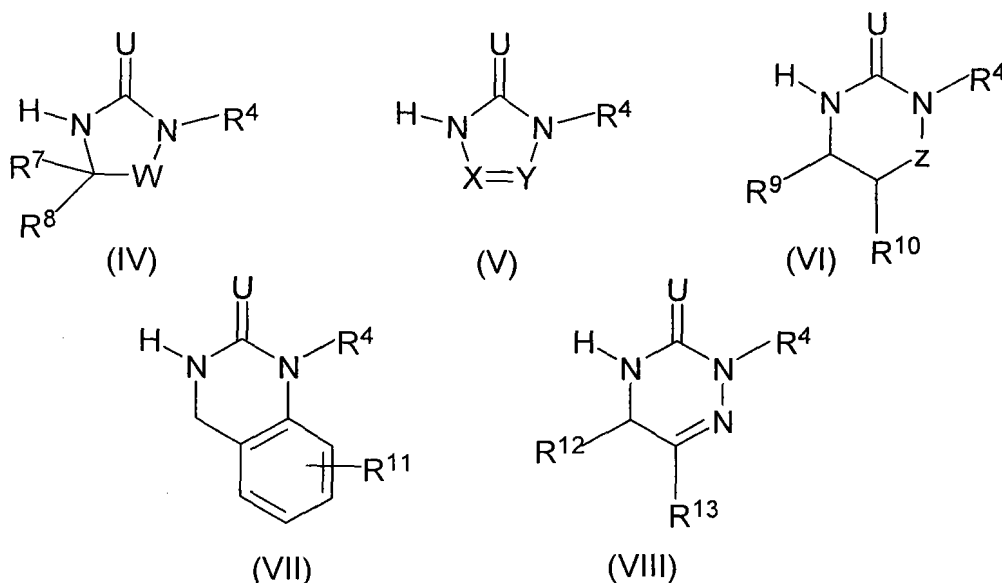
其中 R⁴、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、W、X、Y 和 Z 如上所定义, 该化合物可通过将式 (II) 化合物:



其中 L 为离去基团, 通常为卤素并优选为氯, 与式 (III) 化合物反应制得:

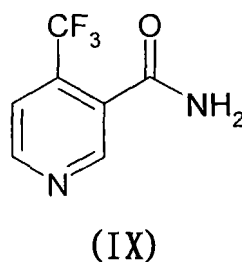


其中 R²、U、R³ 和 R⁴ 如上所定义, 或与式 (IV)、(V)、(VI)、(VII) 或 (VIII) 反应制得:



其中 R^4 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、W、X、Y 和 Z 如上所定义。该反应通常于温度为 0 至 100℃（优选 0 至 50℃）下，在有机碱例如叔胺例如三乙基胺或吡啶，或无机碱例如碱金属碳酸盐如碳酸钾，或碱金属醇盐如乙醇钠或氢化钠的存在下，在溶剂例如二噁烷、四氢呋喃或 N,N-二甲基甲酰胺中进行。

根据本发明式 (I) 化合物的另一特征，其中 R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$ ，m 为 0， R^2 为 H，U 为 O，并且 R^3 和 R^4 如上所定义，该化合物的制备可通过将式 (IX) 化合物：



与草酰氯或三光气，于温度为 0℃ 至溶剂回流温度下，在惰性溶剂如二氯乙烷中反应，随后除去溶剂，得到相应的酰基异氰酸酯中间体，通常不分离该中间体，并且将其直接与式 (X) 的胺反应：



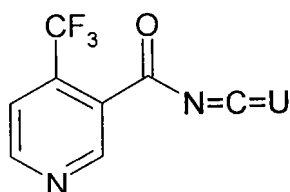
其中 R^3 和 R^4 如上所定义。该反应通常在惰性溶剂如二氯乙烷或四氢呋喃中、于 0 至 60℃ 下进行。

根据本发明式 (I) 化合物的另一特征, 其中 R^1 为 $-C(=V)OR^{3a}$, m 为 0, R^2 为 H, V 为 O, 并且 R^{3a} 如上所定义, 该化合物的制备可通过将如上所定义的式 (IX) 化合物与草酰氯反应, 得到上述酰基异氰酸酯中间体, 通常不分离该中间体, 并且将其直接与式 (XI) 的醇反应:



其中 R^3 如上所定义。该反应通常在惰性溶剂如二氯乙烷或四氢呋喃中、于 0 至 60°C 下进行。

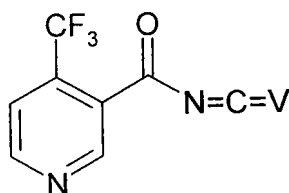
根据本发明式 (I) 化合物的另一特征, 其中 R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$, m 为 0, R^2 为 H, U 为 O 或 S, 并且 R^3 和 R^4 如上所定义, 该化合物的制备可通过将式 (XII) 化合物:



(XII)

其中 U 为 O 或 S, 与上述式 (X) 化合物反应。该反应通常在惰性溶剂如二氯乙烷或四氢呋喃中、于 0 至 60°C 下进行。

根据本发明式 (I) 化合物的另一特征, 其中 R^1 为 $-C(=V)OR^{3a}$, m 为 0, R^2 为 H, V 为 O 或 S, 并且 R^{3a} 如上所定义, 该化合物的制备可通过将式 (XIII) 化合物:



(XIII)

其中 V 为 O 或 S, 与上述式 (XI) 化合物反应。该反应通常在惰性溶剂如二氯乙烷或四氢呋喃中、于 0 至 60°C 下进行。

根据本发明式 (I) 化合物的另一特征, 其中 R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$,

m 为 0, R^2 为 H, R^4 为 H, U 为 O 或 S, 并且 R^3 如上所定义, 该化合物的制备可通过将上述式 (IX) 化合物与强碱如氢氧化钠反应得到相应的盐, 随后将其与式 (XIV) 化合物反应:



其中 R^3 如上所定义。该反应通常在惰性溶剂如二氯乙烷或四氢呋喃中、于 0 至 60℃ 下进行。

根据本发明式 (I) 化合物的另一特征, 其中 R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$ 或 $-C(=V)OR^{3a}$, m 为 0, R^2 为 H, U 和 V 均为 S, 并且 R^3 、 R^{3a} 和 R^4 如上所定义, 该化合物可通过将 4-三氟甲基烟酸与适宜的卤化剂 1-位 (1-pot) 反应制得, 卤化剂优选为草酰氯、在溶剂中如二氯乙烷, 可选含有 N,N-二甲基甲酰胺, 于温度为 0℃ 至溶剂回流温度下进行, 得到相应的酰基氯, 随后除去溶剂, 将其与碱金属硫代氰酸盐或硫代氰酸铵或硫代氰酸四烷基铵如硫代氰酸四丁基铵反应, 通常存在碱例如碱金属碳酸盐如碳酸钾, 在惰性溶剂如甲苯或丙酮中, 于温度为 0℃ 至 60℃ 下进行, 得到 4-三氟甲基-3-吡啶基羰基异硫代氰酸酯, 随后将其与上述式 (X) 的胺或上述式 (XI) 的醇于温度为 0℃ 至 60℃ 下反应。

根据本发明式 (I) 化合物的另一特征, 其中 R^1 为 $-C(=U)NR^3R^4$, m 为 0, U、 R^3 和 R^4 如上所定义, 并且 R^2 为 (C_1-C_6) 烷基、 (C_3-C_6) 链烯基、 (C_3-C_6) 炔基、 (C_3-C_8) 环烷基或 (C_3-C_8) 环烷基- (C_1-C_6) 烷基, 其中该基团是未取代的或由一个或多个 R^6 基团取代的; 或为 $-(CR^{15}R^{16})_p$ 芳基或 $-(CR^{15}R^{16})_p$ 杂环基, 所述芳基或杂环基可选由 R^{17} 取代; 其中 R^6 、 R^{15} 、 R^{16} 和 R^{17} 如上所定义, 该化合物可通过利用式 (XV) 的烷烃化剂与相应的式 (I) 化合物 (其中 R^2 为 H) 反应制得:



其中 L^1 为离去基团, 通常为卤素, 优选为氯。该反应通常于温度为 0 至 100℃ (优选 0 至 50℃) 下, 在有机碱例如叔胺例如三乙胺或吡啶, 或无机碱例如碱金属碳酸盐如碳酸钾, 或碱金属醇盐如乙醇钠或氢氧化钠下, 在溶剂例如二噁烷、四氢呋喃或 N,N-二甲基甲酰胺

胺中进行。

根据本发明式 (I) 化合物的另一特征, 其中 R^1 、 R^2 如上所定义, 并且 m 为 1, 该化合物可通过氧化相应的化合物 (其中 m 为 0) 制得。该氧化反应通常利用过氧化氢在溶剂如乙酸, 或过酸如 3-氯过苯甲酸在溶剂如二氯甲烷或 1,2-二氯乙烷中, 于温度为 0°C 至溶剂回流温度下进行。

式 (II) 中间体 (其中 L 为氯) 可根据已知方法制备, 例如通过将相应的式 (II) 羧酸 (其中 L 由 OH 取代) 与适宜的卤化剂反应, 优选草酰氯或亚硫酰氯, 在溶剂如二氯乙烷中, 可选存在 N,N -二甲基甲酰胺, 于温度为 0°C 至溶剂回流温度下进行。

式 (XII) 的中间体 (其中 U 为 S) 和式 (XIII) 的中间体 (其中 V 为 0) 可根据已知方法制备, 例如通过将上述式 (II) 化合物与碱金属硫代氰酸盐或硫代氰酸铵或硫代氰酸四烷基铵如硫代氰酸四丁基铵反应, 通常存在碱如碱金属碳酸盐如碳酸钾, 在惰性溶剂如甲苯或丙酮中, 于温度为 0°C 至 100°C 下进行。

式 (XII) 的中间体 (其中 U 为 0) 可根据已知方法制备, 例如通过将上述式 (II) 化合物与碱金属氰酸盐或氰酸铵或氰酸四烷基铵如氰酸四丁基铵反应, 通常存在碱如碱金属碳酸盐如碳酸钾, 在惰性溶剂如甲苯中, 于温度为 0°C 至 100°C 下进行。

根据上述方法可以合成的式 (I) 化合物的集合, 也可以用并列进行的方式制备, 其可以用手工、半自动或全自动的方式。在此有可能例如将反应的实施、产物或中间产物的处理或提纯自动化。总体上对此理解作为一种例如通过 S.H. DeWitt 在“组合化学和分子多样性年报: 自动化合成 (Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis)”, 第 1 册, Verlag Escom 1997, 第 69 至 77 页所描述的方法。

可以使用一系列的商购装置用于并行的反应实施及处理, 例如公司 Stem Corporation (Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8S E, 英国) 或 H + P Labortechnik GmbH (Bruckmannring 28, 85764

Oberschleißheim, 德国) 或 Radleys 公司 (Shirehill, Saffron Walden, Essex, 英国) 提供的装置。提供用于并列进行提纯式 (I) 的化合物以及在制备过程中出现的中间产物的还有色谱仪, 例如公司 ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA 的装置。

将所述装置以组合方式使用, 其中将各个工作步骤自动化, 在工作步骤之间却必须以手工操作进行。这也可以通过部分或完全整合的自动化体系的应用, 其中将各自动化组件例如通过机器人操作。所述自动化系统例如可从 Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, USA 获得。

在此描述之外, 通式 (I) 的化合物可以完全或部分通过固相支持的方法制备。出于此目的, 将合成的各中间步骤或所有中间步骤或一种与于进行方式相适应的合成与合成树脂相结合。固相支持的合成方法在专业文献中有足够的描述, 例如 Barry A. Bunin 在“组合标记 (The Combinatorial Index)”, Academic Press, 1998。

对于经固相支持的合成方法的应用有一系列文献已知的报告, 其可以手工或自动方式实施。例如 IRORI 公司 (11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, USA) 的产品以“茶包法” (Houghten, US 4,631,211; Houghten 等人, Proc. Natl. Acad. Sci. 1985, 82, 5131-5135) 可以部份自动化。经固相支持的并行合成法例如可通过公司 Argonaut Technologies, Inc. (887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, USA) 或 MultiSyn Tech GmbH (Wullener Feld 4, 58454 Witten, 德国) 的装置达到自动化。

在此描述的制备方法是以物质集合的形式 (称之为集合库) 提供式 (I) 化合物的。本发明的也涉及该集合库, 其包含至少两种式 (I) 的化合物。

式 (II)、(III)、(IV)、(V)、(VI)、(VII)、(VIII)、(IX)、(X)、(XI)、(XIV) 和 (XV) 化合物是已知的或可以由已知方法制备。

下面的非限制性实施例说明式 (I) 化合物的制备。

化学实施例

除非另有说明 NMR 光谱以氘代三氯甲烷进行。

下面的实施例中，除非另有说明，数量值（以及百分比）是基于重量的。

实施例 1

在 20℃，将草酰氯（0.15ml）加入 4-三氟甲基-3-吡啶甲酰胺（0.25g）的 1,2-二氯乙烷悬浮液中，随后加热回流 2 小时。将混合物冷却、蒸发，并将含 4-三氟甲基-3-吡啶羰基异氰酸酯的残余物溶解在四氢呋喃中。加入苄胺（0.15ml），并将混合物在 20℃搅拌 2 小时并蒸发。残余物通过用正己烷/乙酸乙酯（3:2）洗脱的硅胶柱层析进行纯化，得到 1-苄基-3-(4-三氟甲基-3-吡啶羰基)脲（0.30g，化合物 A-37）。

以类似的方法制备 1-苄基-1-(2-羟乙基)-3-(4-三氟甲基-3-吡啶羰基)脲（化合物 A-862）。

实施例 2

在 20℃，将草酰氯（1.50ml）加入 4-三氟甲基-3-吡啶甲酰胺（2.0g）的 1,2-二氯乙烷悬浮液中，并且搅拌回流 2 小时。蒸发混合物，并将二氯甲烷加至含有 4-三氟甲基-3-吡啶羰基异氰酸酯的残余物中。在 20℃将提前制备好的 N,0-二甲基羟基胺氢氯化物（2.05g）和三乙胺（3.0ml）的二氯甲烷悬浮剂加至上述混合物中。搅拌混合物 30 分钟，随后加入水并将有机层干燥（硫酸镁）并蒸发，用乙醇研磨后得到 1-甲基-1-甲氧基-3-(4-三氟甲基-3-吡啶羰基)脲（2.2g）（化合物 A-313）。

以类似的方法制备 1-羟基-1-异丙基-3-(4-三氟甲基-3-吡啶羰基)脲（化合物 A-540）。

实施例 3

在 20℃，将氢化钠（0.090g，60%分散在矿物油中）加至 4-三氟甲基-3-吡啶甲酰胺（0.40g）的 N,N-二甲基甲酰胺溶液中，并且搅拌 1 小时。将异硫氰酸苄酯（0.31ml）加至混合物中，并且在 20℃搅拌 2 小时，随后加入甲基溴乙酸酯（0.30 ml），并且连续搅拌 5 小时。将乙酸乙酯和水加至溶液，并且干燥有机相（硫酸镁），蒸发并且通过用正己烷/乙酸乙酯（2:1）洗脱的硅胶柱层析进行纯化，得到 3-苄基-1-(4-三氟甲基-3-吡啶羰基)乙内酰脲（0.50g，化合物 S-132）。

实施例 4

将甲基磺酰氯（0.17ml）加至 1-苄基-1-(2-羟乙基)-3-(4-三氟甲基-3-吡啶羰基)脲（0.70g）和三乙胺（0.64ml）的二氯甲烷的冰冷却混合物中，随后在 20℃搅拌 3 小时。将混合物洗涤（水）、干燥（硫酸镁）、蒸发并且通过用正己烷/乙酸乙酯（3:2）洗脱的硅胶层析进行纯化，得到 1-苄基-3-(4-三氟甲基-3-吡啶羰基)-2-咪唑啉二酮（0.63g，化合物 S-15）。

实施例 5

在 20℃，将 1,2-二溴乙烷（0.06ml）加至 1-羟基-1-异丙基-3-(4-三氟甲基-3-吡啶羰基)脲（0.20g）和碳酸钾（0.20g）的 N,N-二甲基甲酰胺悬浮液中，并且搅拌 3 小时。加入乙酸乙酯和水并且干燥有机相（硫酸镁），蒸发并且通过用正己烷/乙酸乙酯（2:1）洗脱的硅胶柱层析进行纯化，得到 2-异丙基-4-(4-三氟甲基-3-吡啶羰基)-全氢化-1,2,4-噁二嗪-3-酮（0.25g，化合物 U-3）。

实施例 6

将草酰氯（3.2ml，2M）加至 4-三氟甲基烟酸（1g）和催化量的 N,N-二甲基甲酰胺的二氯甲烷悬浮液中，并在 20℃搅拌 1 小时。蒸发后，残余物溶解在丙酮中，并且用冰浴冷却加入硫氰酸钾（1g），得

到 4-三氟甲基-3-吡啶羰基异硫氰酸酯，随后加入 N-甲基苯胺 (0.65g) 并将混合物在 20℃ 搅拌 1 小时。加入乙酸乙酯并将混合物用水洗涤、干燥 (硫酸镁)、蒸发并且通过用正己烷/乙酸乙酯 = 2/1 洗脱的硅胶层析进行纯化，得到 1-甲基-1-苯基-3-(4-三氟甲基-3-吡啶羰基) 硫脲 (0.96g, 化合物 B-349)。

实施例 7

将草酰氯 (6.4ml, 2M) 加至 4-三氟甲基烟酸 (2g) 和催化量的 N,N-二甲基甲酰胺的二氯甲烷悬浮液中，并在 20℃ 搅拌 1 小时，得到 4-三氟甲基烟酸氯溶液。将 N,N-乙烯硫脲 (2.23g) 加至氢化钠 (0.82g, 60% 分散在矿物油中) 的四氢呋喃中，并将混合物在 20℃ 搅拌 1 小时，然后将其加至上述用冰浴冷却的 4-三氟甲基烟酸氯溶液中，随后在 20℃ 搅拌 1 小时。加入乙酸乙酯并将混合物用水洗涤、干燥 (硫酸镁)、蒸发并且残余物结晶 (乙醇)，得到 N-(4-三氟甲基-3-吡啶羰基)-咪唑啉-2-硫酮 (1.35g, 化合物 S-356)。

实施例 8

将草酰氯 (9.6ml, 2M) 加至 4-三氟甲基烟酸 (3g) 和催化量的 N,N-二甲基甲酰胺的二氯甲烷悬浮液中，并在 20℃ 搅拌 1 小时。蒸发混合物，残余物溶解在甲苯中，并加入硫氰酸四丁基铵 (3g) 和碳酸钾 (1.5g)，然后在 20℃ 搅拌 30 分钟，得到 4-三氟甲基-3-吡啶羰基异硫氰酸酯，随后加入 2,2,2-三氟乙醇 (3.15)，并将混合物在 20℃ 搅拌 1 小时。加入乙酸乙酯并将混合物用水、盐酸 (1M)、饱和碳酸氢钠和盐水洗涤，干燥 (硫酸镁)，蒸发并且用乙醇进行重结晶，得到 2,2,2-三氟乙基 N-(4-三氟甲基-3-吡啶羰基) 硫代氨基甲酸酯 (1.2g, 化合物 X-45)。

实施例 9

在 20℃，将烯丙基溴 (0.10ml) 加至 1-甲基-1-甲氧基-3-(4-三

氟甲基-3-吡啶羰基)脲 (0.25g) 和碳酸钾 (0.16) 的 N,N-二甲基甲酰胺的悬浮液中, 并且搅拌 2 小时。加入乙酸乙酯和水并且干燥有机相 (硫酸镁), 蒸发并且通过用正己烷/乙酸乙酯 (2:1) 洗脱的硅胶柱层析进行纯化, 得到 1-甲基-1-甲氧基-3-烯丙基-3-(4-三氟甲基-3-吡啶羰基)脲 (0.26g, 化合物 E-85)。

下面示于表 1 至 9 中的优选化合物是本发明的一部分, 并且可以根据、或类似于上述实施例 1 至 9 或上述常规方法加以制备。

在表中, Ph 指苯基。其中原子后省略下标的应理解为这是有意, 例如 CH₃ 指 CH₃。

对涉及的化合物所给定的化合物号是唯一的。

表 1

式 (I) 化合物, 其中 R¹ 为 -C(=U)NR³R⁴; R² 为 H 并且 m 为 0。表 1 中, 化合物 A-1 至 A-881 表示 U 为 O 的不同化合物, 同时化合物 B-1 至 B-881 表示 U 为 S 的不同化合物。

化合物		R ³	R ⁴
A-1	B-1	CH ₃ CH=CH	H
A-2	B-2	CH ₂ =CHCH ₂	H
A-3	B-3	CH ₃ (CH ₃)C=CH	H
A-4	B-4	(CH ₃) ₂ C=CH	H
A-5	B-5	CH ₃ CH=CHCH ₂	H
A-6	B-6	CH ₂ =C(CH ₃)CH ₂	H
A-7	B-7	CH ₃ CH=C(CH ₃)CH ₂	H
A-8	B-8	CH ₂ =CHCH ₂ CH ₂	H
A-9	B-9	CH ₃ CH ₂ (CH ₃)C=CH	H
A-10	B-10	(CH ₃) ₂ CHCH=CH	H
A-11	B-11	CH ₂ CH ₂ CH=CHCH ₂	H
A-12	B-12	CH ₃ CH=C(CH ₃)CH ₂	H
A-13	B-13	CH(CH ₃)HC=CHCH ₃	H
A-14	B-14	CH ₂ HC=C(CH ₃) ₂	H
A-15	B-15	CH ₃ CH=CHCH ₂ CH ₂	H
A-16	B-16	CH ₂ =CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H
A-17	B-17	CH ₂ =CH ₂ CH ₂ CH ₂ CHCH ₂	H
A-18	B-18	CHCCH ₂	H
A-19	B-19	CH ₃ CCCH ₂	H

化合物		R ³	R ⁴
A-20	B-20	CHCCH(CH ₃)	H
A-21	B-21	CH ₃ CCCH(CH ₃)	H
A-22	B-22	CHCC(CH ₃) ₂	H
A-23	B-23	CH ₃ CCC(CH ₃) ₂	H
A-24	B-24	环-C ₃ H ₅	H
A-25	B-25	环-C ₃ H ₄ (-CH ₃)	H
A-26	B-26	环-C ₄ H ₇	H
A-27	B-27	环-C ₄ H ₆ (-CH ₃)	H
A-28	B-28	环-C ₅ H ₉	H
A-29	B-29	环-C ₅ H ₈ (-CH ₃)	H
A-30	B-30	环-C ₆ H ₁₁	H
A-31	B-31	环-C ₆ H ₁₀ (-CH ₃)	H
A-32	B-32	(环-C ₃ H ₅)CH ₂	H
A-33	B-33	(环-C ₃ H ₄ (-CH ₃))CH ₂	H
A-34	B-34	(环-C ₄ H ₇)CH ₂	H
A-35	B-35	(环-C ₅ H ₉)CH ₂	H
A-36	B-36	(环-C ₆ H ₁₁)CH ₂	H
A-37	B-37	PhCH ₂	H
A-38	B-38	PhCH(CH ₃)	H
A-39	B-39	PhCH ₂ CH ₂	H
A-40	B-40	PhC(CH ₃) ₂	H
A-41	B-41	PhCH ₂ CH ₂	H
A-42	B-42	(2-F-Ph)CH ₂	H
A-43	B-43	(3-F-Ph)CH ₂	H
A-44	B-44	(4-F-Ph)CH ₂	H
A-45	B-45	(2-Cl-Ph)CH ₂	H
A-46	B-46	(3-Cl-Ph)CH ₂	H
A-47	B-47	(4-Cl-Ph)CH ₂	H
A-48	B-48	(2-Br-Ph)CH ₂	H
A-49	B-49	(3-Br-Ph)CH ₂	H
A-50	B-50	(4-Br-Ph)CH ₂	H
A-51	B-51	(2-I-Ph)CH ₂	H
A-52	B-52	(3-I-Ph)CH ₂	H
A-53	B-53	(4-I-Ph)CH ₂	H
A-54	B-54	(2-CF ₃ -Ph)CH ₂	H
A-55	B-55	(3-CF ₃ -Ph)CH ₂	H
A-56	B-56	(4-CF ₃ -Ph)CH ₂	H
A-57	B-57	(2-CH ₃ -Ph)CH ₂	H
A-58	B-58	(3-CH ₃ -Ph)CH ₂	H
A-59	B-59	(4-CH ₃ -Ph)CH ₂	H
A-60	B-60	(2-CH ₃ O-Ph)CH ₂	H
A-61	B-61	(3-CH ₃ O-Ph)CH ₂	H
A-62	B-62	(4-CH ₃ O-Ph)CH ₂	H

化合物		R ³	R ⁴
A-63	B-63	HO	H
A-64	B-64	CH ₃ O	H
A-65	B-65	CH ₃ CH ₂ O	H
A-66	B-66	正-C ₃ H ₇ O	H
A-67	B-67	异-C ₃ H ₇ O	H
A-68	B-68	正-C ₄ H ₉ O	H
A-69	B-69	仲-C ₄ H ₉ O	H
A-70	B-70	异-C ₄ H ₉ O	H
A-71	B-71	叔-C ₄ H ₉ O	H
A-72	B-72	正-C ₅ H ₁₁ O	H
A-73	B-73	正-C ₆ H ₁₃ O	H
A-74	B-74	CH ₂ =CHCH ₂ O	H
A-75	B-75	CH ₂ =C(CH ₃)CH ₂ O	H
A-76	B-76	CH ₂ =CHCH(CH ₃)O	H
A-77	B-77	CH ₂ =C(Cl)CH ₂ O	H
A-78	B-78	CH ₂ =CHC(CH ₃) ₂ O	H
A-79	B-79	CH ₃ CH=CHCH ₂ O	H
A-80	B-80	CH ₂ =CH ₂ CH ₂ CH ₂ O	H
A-81	B-81	CHCCH ₂ O	H
A-82	B-82	CH ₃ CCCH ₂ O	H
A-83	B-83	CHCCH(CH ₃)O	H
A-84	B-84	CHCC(CH ₃) ₂ O	H
A-85	B-85	CH ₃ CH ₂ O ₂ CCH ₂ O	H
A-86	B-86	PhCH ₂ O	H
A-87	B-87	2-CH ₃ O-PhCH ₂ O	H
A-88	B-88	3-CH ₃ O-PhCH ₂ O	H
A-89	B-89	4-CH ₃ O-PhCH ₂ O	H
A-90	B-90	PhO	H
A-91	B-91	2-Cl-PhO	H
A-92	B-92	3-Cl-PhO	H
A-93	B-93	4-Cl-PhO	H
A-94	B-94	2-CF ₃ -PhO	H
A-95	B-95	3-CF ₃ -PhO	H
A-96	B-96	4-CF ₃ -PhO	H
A-97	B-97	2-CH ₃ O-PhO	H
A-98	B-98	3-CH ₃ O-PhO	H
A-99	B-99	4-CH ₃ O-PhO	H
A-100	B-100	NH ₂	H
A-101	B-101	CH ₃ NH	H
A-102	B-102	C ₂ H ₅ NH	H
A-103	B-103	正-C ₃ H ₇ NH	H
A-104	B-104	异-C ₃ H ₇ NH	H
A-105	B-105	正-C ₄ H ₉ NH	H

化合物		R ³	R ⁴
A-106	B-106	正-C ₅ H ₁₁ NH	H
A-107	B-107	正-C ₆ H ₁₃ NH	H
A-108	B-108	PhCH ₂ NH	H
A-109	B-109	PhNH	H
A-110	B-110	2-F-PhNH	H
A-111	B-111	3-F-PhNH	H
A-112	B-112	4-F-PhNH	H
A-113	B-113	2-Cl-PhNH	H
A-114	B-114	3-Cl-PhNH	H
A-115	B-115	4-Cl-PhNH	H
A-116	B-116	2-Br-PhNH	H
A-117	B-117	3-Br-PhNH	H
A-118	B-118	4-Br-PhNH	H
A-119	B-119	2-I-PhNH	H
A-120	B-120	3-I-PhNH	H
A-121	B-121	4-I-PhNH	H
A-122	B-122	2-CF ₃ -PhNH	H
A-123	B-123	3-CF ₃ -PhNH	H
A-124	B-124	4-CF ₃ -PhNH	H
A-125	B-125	2-CH ₃ -PhNH	H
A-126	B-126	3-CH ₃ -PhNH	H
A-127	B-127	4-CH ₃ -PhNH	H
A-128	B-128	2-CH ₃ O-PhNH	H
A-129	B-129	3-CH ₃ O-PhNH	H
A-130	B-130	4-CH ₃ O-PhNH	H
A-131	B-131	2-NO ₂ -PhNH	H
A-132	B-132	3-NO ₂ -PhNH	H
A-133	B-133	4-NO ₂ -PhNH	H
A-134	B-134	2-CN-PhNH	H
A-135	B-135	3-CN-PhNH	H
A-136	B-136	4-CN-PhNH	H
A-137	B-137	Ph (Me) N	H
A-138	B-138	2-F-Ph (Me) N	H
A-139	B-139	3-F-Ph (Me) N	H
A-140	B-140	4-F-Ph (Me) N	H
A-141	B-141	2-Cl-Ph (Me) N	H
A-142	B-142	3-Cl-Ph (Me) N	H
A-143	B-143	4-Cl-Ph (Me) N	H
A-144	B-144	3-CF ₃ -Ph (Me) N	H
A-145	B-145	4-CF ₃ -Ph (Me) N	H
A-146	B-146	2-CH ₃ O-Ph (Me) N	H
A-147	B-147	3-CH ₃ O-Ph (Me) N	H
A-148	B-148	4-CH ₃ O-Ph (Me) N	H

化合物		R ³	R ⁴
A-149	B-149	Ph	H
A-150	B-150	2-F-Ph	H
A-151	B-151	3-F-Ph	H
A-152	B-152	4-F-Ph	H
A-153	B-153	2-Cl-Ph	H
A-154	B-154	3-Cl-Ph	H
A-155	B-155	4-Cl-Ph	H
A-156	B-156	2-Br-Ph	H
A-157	B-157	3-Br-Ph	H
A-158	B-158	4-Br-Ph	H
A-159	B-159	2-I-Ph	H
A-160	B-160	3-I-Ph	H
A-161	B-161	4-I-Ph	H
A-162	B-162	2-CF ₃ -Ph	H
A-163	B-163	3-CF ₃ -Ph	H
A-164	B-164	4-CF ₃ -Ph	H
A-165	B-165	2-CH ₃ -Ph	H
A-166	B-166	3-CH ₃ -Ph	H
A-167	B-167	4-CH ₃ -Ph	H
A-168	B-168	2-CH ₃ O-Ph	H
A-169	B-169	3-CH ₃ O-Ph	H
A-170	B-170	4-CH ₃ O-Ph	H
A-171	B-171	2-NO ₂ -Ph	H
A-172	B-172	3-NO ₂ -Ph	H
A-173	B-173	4-NO ₂ -Ph	H
A-174	B-174	2-CN-Ph	H
A-175	B-175	3-CN-Ph	H
A-176	B-176	4-CN-Ph	H
A-177	B-177	2-CO ₂ H-Ph	H
A-178	B-178	3-CO ₂ H-Ph	H
A-179	B-179	4-CO ₂ H-Ph	H
A-180	B-180	2-CO ₂ Me-Ph	H
A-181	B-181	3-CO ₂ Me-Ph	H
A-182	B-182	4-CO ₂ Me-Ph	H
A-183	B-183	2-HO-Ph	H
A-184	B-184	3-HO-Ph	H
A-185	B-185	4-HO-Ph	H
A-186	B-186	2-NH ₂ -Ph	H
A-187	B-187	3-NH ₂ -Ph	H
A-188	B-188	4-NH ₂ -Ph	H
A-189	B-189	2-HOCH ₂ -Ph	H
A-190	B-190	3-HOCH ₂ -Ph	H
A-191	B-191	4-HOCH ₂ -Ph	H

化合物		R ³	R ⁴
A-192	B-192	2-CF ₃ O-Ph	H
A-193	B-193	3-CF ₃ O-Ph	H
A-194	B-194	4-CF ₃ O-Ph	H
A-195	B-195	2-CF ₃ CH ₂ O-Ph	H
A-196	B-196	3-CF ₃ CH ₂ O-Ph	H
A-197	B-197	4-CF ₃ CH ₂ O-Ph	H
A-198	B-198	2-(4-C1-PhO)-Ph	H
A-199	B-199	3-(4-C1-PhO)-Ph	H
A-200	B-200	4-(4-C1-PhO)-Ph	H
A-201	B-201	2-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	H
A-202	B-202	3-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	H
A-203	B-203	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	H
A-204	B-204	2,3-二氯-Ph	H
A-205	B-205	2,5-二氯-Ph	H
A-206	B-206	2,6-二氯-Ph	H
A-207	B-207	3,4-二氯-Ph	H
A-208	B-208	3,5-二氯-Ph	H
A-209	B-209	2-吡啶基	H
A-210	B-210	3-吡啶基	H
A-211	B-211	4-吡啶基	H
A-212	B-212	2-嘧啶基	H
A-213	B-213	1-吡咯基	H
A-214	B-214	1-吡唑基	H
A-215	B-215	3-吡唑基	H
A-216	B-216	1,2,4-三唑-1-基	H
A-217	B-217	1,2,4-三唑-3-基	H
A-218	B-218	2-咪唑基	H
A-219	B-219	3-咪唑基	H
A-220	B-220	2-噻吩基	H
A-221	B-221	3-噻吩基	H
A-222	B-222	2-噻唑基	H
A-223	B-223	1,3,4-噻二唑-2-基	H
A-224	B-224	3-异噻唑基	H
A-225	B-225	CH ₃ CO	H
A-226	B-226	CH ₃ CH ₂ CO	H
A-227	B-227	正-C ₃ H ₇ CO	H
A-228	B-228	异-C ₃ H ₇ CO	H
A-229	B-229	正-C ₄ H ₉ CO	H
A-230	B-230	异-C ₄ H ₉ CO	H
A-231	B-231	仲-C ₄ H ₉ CO	H
A-232	B-232	叔-C ₄ H ₉ CO	H
A-233	B-233	正-C ₅ H ₁₁ CO	H
A-234	B-234	正-C ₆ H ₁₃ CO	H

化合物		R ³	R ⁴
A-235	B-235	PhCO	H
A-236	B-236	PhCH ₂ CO	H
A-237	B-237	CH ₃ SO ₂	H
A-238	B-238	C ₂ H ₅ SO ₂	H
A-239	B-239	正-C ₃ H ₇ SO ₂	H
A-240	B-240	异-C ₃ H ₇ SO ₂	H
A-241	B-241	PhCH ₂ SO ₂	H
A-242	B-242	PhSO ₂	H
A-243	B-243	2-Cl-PhSO ₂	H
A-244	B-244	3-Cl-PhSO ₂	H
A-245	B-245	4-Cl-PhSO ₂	H
A-246	B-246	CH ₃ SO ₂ NH	H
A-247	B-247	PhSO ₂ NH	H
A-248	B-248	CF ₃ CH ₂	H
A-249	B-249	ClCH ₂ CH ₂	H
A-250	B-250	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
A-251	B-251	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	H
A-252	B-252	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	H
A-253	B-253	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
A-254	B-254	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
A-255	B-255	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
A-256	B-256	(CH ₃ O) ₂ CHCH ₂	H
A-257	B-257	CH ₃ CONH	H
A-258	B-258	PhCONH	H
A-259	B-259	Ph ₂ C=N	H
A-260	B-260	HOCH ₂ CH ₂	H
A-261	B-261	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
A-262	B-262	CH ₃ O ₂ CCH ₂	H
A-263	B-263	CH ₃ O ₂ CCH(CH ₃)	H
A-264	B-264	CH ₃ O ₂ CC(CH ₃) ₂	H
A-265	B-265	NCCH ₂	H
A-266	B-266	NCCH(CH ₃)	H
A-267	B-267	NCC(CH ₃) ₂	H
A-268	B-268	NC(CH ₃)(异-C ₃ H ₇)C	H
A-269	B-269	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H
A-270	B-270	CHCCH ₂ O	H
A-271	B-271	CH ₃ O ₂ CCH ₂ O	H
A-272	B-272	CH ₃ O ₂ CCH(CH ₃)O	H
A-273	B-273	CH ₃ O ₂ CC(CH ₃) ₂ O	H
A-274	B-274	(1-吡咯烷基)CH ₂ CH ₂	H
A-275	B-275	CH ₂ =CHCH ₂	CH ₃
A-276	B-276	CH ₃ CH=CHCH ₂	CH ₃
A-277	B-277	CH ₂ =C(CH ₃)CH ₂	CH ₃

化合物		R ³	R ⁴
A-278	B-278	CH ₂ =CH(CH ₃)CH	CH ₃
A-279	B-279	CH ₂ =CHCH ₂ CH ₂	CH ₃
A-280	B-280	CH ₃ CH=C(CH ₃)CH ₂	CH ₃
A-281	B-281	CH(CH ₃)HC=CHCH ₃	CH ₃
A-282	B-282	C(CH ₃) ₂ HC=CH ₂	CH ₃
A-283	B-283	CH ₂ HC=C(CH ₃) ₂	CH ₃
A-284	B-284	CH ₃ CH=CHCH ₂ CH ₂	CH ₃
A-285	B-285	CH ₂ =CHCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
A-286	B-286	CHCCH ₂	CH ₃
A-287	B-287	CH ₃ CCCH ₂	CH ₃
A-288	B-288	CHCCH(CH ₃)	CH ₃
A-289	B-289	CH ₃ CCCH(CH ₃)	CH ₃
A-290	B-290	环-C ₃ H ₅	CH ₃
A-291	B-291	环-C ₅ H ₉	CH ₃
A-292	B-292	环-C ₆ H ₁₁	CH ₃
A-293	B-293	(环-C ₃ H ₅)CH ₂	CH ₃
A-294	B-294	(环-C ₅ H ₉)CH ₂	CH ₃
A-295	B-295	(环-C ₆ H ₁₁)CH ₂	CH ₃
A-296	B-296	PhCH ₂	CH ₃
A-297	B-297	PhCH(CH ₃)	CH ₃
A-298	B-298	PhC(CH ₃) ₂	CH ₃
A-299	B-299	PhCH ₂ CH ₂	CH ₃
A-300	B-300	(2-F-Ph)CH ₂	CH ₃
A-301	B-301	(3-F-Ph)CH ₂	CH ₃
A-302	B-302	(4-F-Ph)CH ₂	CH ₃
A-303	B-303	(2-Cl-Ph)CH ₂	CH ₃
A-304	B-304	(3-Cl-Ph)CH ₂	CH ₃
A-305	B-305	(4-Cl-Ph)CH ₂	CH ₃
A-306	B-306	(2-CF ₃ -Ph)CH ₂	CH ₃
A-307	B-307	(3-CF ₃ -Ph)CH ₂	CH ₃
A-308	B-308	(4-CF ₃ -Ph)CH ₂	CH ₃
A-309	B-309	(2-CH ₃ O-Ph)CH ₂	CH ₃
A-310	B-310	(3-CH ₃ O-Ph)CH ₂	CH ₃
A-311	B-311	(4-CH ₃ O-Ph)CH ₂	CH ₃
A-312	B-312	HO	CH ₃
A-313	B-313	CH ₃ O	CH ₃
A-314	B-314	CH ₃ CH ₂ O	CH ₃
A-315	B-315	正-C ₃ H ₇ O	CH ₃
A-316	B-316	异-C ₃ H ₇ O	CH ₃
A-317	B-317	CH ₂ =CHCH ₂ O	CH ₃
A-318	B-318	CH ₂ =C(CH ₃)CH ₂ O	CH ₃
A-319	B-319	CH ₂ =CHCH(CH ₃)O	CH ₃
A-320	B-320	CH ₂ =CHCH(CH ₃)O	CH ₃

化合物		R ³	R ⁴
A-321	B-321	CH ₂ =CHC(CH ₃) ₂ O	CH ₃
A-322	B-322	CH ₃ CH=CHCH ₂ O	CH ₃
A-323	B-323	CHCCH ₂ O	CH ₃
A-324	B-324	CH ₃ CCCH ₂ O	CH ₃
A-325	B-325	CHCCH(CH ₃)O	CH ₃
A-326	B-326	CH ₃ O ₂ CCH(CH ₃)O	CH ₃
A-327	B-327	CH ₃ O ₂ CC(CH ₃) ₂ O	CH ₃
A-328	B-328	CH ₃ O ₂ CCH ₂ O	CH ₃
A-329	B-329	PhCH ₂ O	CH ₃
A-330	B-330	PhO	CH ₃
A-331	B-331	NH ₂	CH ₃
A-332	B-332	CH ₃ NH	CH ₃
A-333	B-333	C ₂ H ₅ NH	CH ₃
A-334	B-334	正-C ₃ H ₇ NH	CH ₃
A-335	B-335	异-C ₃ H ₇ NH	CH ₃
A-336	B-336	PhCH ₂ NH	CH ₃
A-337	B-337	PhNH	CH ₃
A-338	B-338	2-F-PhNH	CH ₃
A-339	B-339	3-F-PhNH	CH ₃
A-340	B-340	4-F-PhNH	CH ₃
A-341	B-341	2-Cl-PhNH	CH ₃
A-342	B-342	3-Cl-PhNH	CH ₃
A-343	B-343	4-Cl-PhNH	CH ₃
A-344	B-344	2-CF ₃ -PhNH	CH ₃
A-345	B-345	3-CF ₃ -PhNH	CH ₃
A-346	B-346	2-CH ₃ O-PhNH	CH ₃
A-347	B-347	3-CH ₃ O-PhNH	CH ₃
A-348	B-348	4-CH ₃ O-PhNH	CH ₃
A-349	B-349	Ph	CH ₃
A-350	B-350	2-F-Ph	CH ₃
A-351	B-351	3-F-Ph	CH ₃
A-352	B-352	4-F-Ph	CH ₃
A-353	B-353	2-Cl-Ph	CH ₃
A-354	B-354	3-Cl-Ph	CH ₃
A-355	B-355	4-Cl-Ph	CH ₃
A-356	B-356	2-Br-Ph	CH ₃
A-357	B-357	3-Br-Ph	CH ₃
A-358	B-358	4-Br-Ph	CH ₃
A-359	B-359	2-I-Ph	CH ₃
A-360	B-360	3-I-Ph	CH ₃
A-361	B-361	4-I-Ph	CH ₃
A-362	B-362	2-CF ₃ -Ph	CH ₃
A-363	B-363	3-CF ₃ -Ph	CH ₃

化合物		R ³	R ⁴
A-364	B-364	4-CF ₃ -Ph	CH ₃
A-365	B-365	2-CH ₃ -Ph	CH ₃
A-366	B-366	3-CH ₃ -Ph	CH ₃
A-367	B-367	4-CH ₃ -Ph	CH ₃
A-368	B-368	2-CH ₃ O-Ph	CH ₃
A-369	B-369	3-CH ₃ O-Ph	CH ₃
A-370	B-370	4-CH ₃ O-Ph	CH ₃
A-371	B-371	2-NO ₂ -Ph	CH ₃
A-372	B-372	3-NO ₂ -Ph	CH ₃
A-373	B-373	4-NO ₂ -Ph	CH ₃
A-374	B-374	2-CN-Ph	CH ₃
A-375	B-375	3-CN-Ph	CH ₃
A-376	B-376	4-CN-Ph	CH ₃
A-377	B-377	2-CO ₂ Me-Ph	CH ₃
A-378	B-378	3-CO ₂ Me-Ph	CH ₃
A-379	B-379	4-CO ₂ Me-Ph	CH ₃
A-380	B-380	2-HO-Ph	CH ₃
A-381	B-381	3-HO-Ph	CH ₃
A-382	B-382	4-HO-Ph	CH ₃
A-383	B-383	2-NH ₂ -Ph	CH ₃
A-384	B-384	3-NH ₂ -Ph	CH ₃
A-385	B-385	4-NH ₂ -Ph	CH ₃
A-386	B-386	2-CF ₃ O-Ph	CH ₃
A-387	B-387	3-CF ₃ O-Ph	CH ₃
A-388	B-388	4-CF ₃ O-Ph	CH ₃
A-389	B-389	4-CF ₃ CH ₂ O-Ph	CH ₃
A-390	B-390	4-(4-Cl-PhO)-Ph	CH ₃
A-391	B-391	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	CH ₃
A-392	B-392	2, 3-二氯-Ph	CH ₃
A-393	B-393	2, 4-二氯-Ph	CH ₃
A-394	B-394	2, 5-二氯-Ph	CH ₃
A-395	B-395	2, 6-二氯-Ph	CH ₃
A-396	B-396	3, 4-二氯-Ph	CH ₃
A-397	B-397	3, 5-二氯-Ph	CH ₃
A-398	B-398	2-吡啶基	CH ₃
A-399	B-399	3-吡啶基	CH ₃
A-400	B-400	4-吡啶基	CH ₃
A-401	B-401	2-嘧啶基	CH ₃
A-402	B-402	1-吡咯基	CH ₃
A-403	B-403	1-吡唑基	CH ₃
A-404	B-404	3-吡唑基	CH ₃
A-405	B-405	1, 2, 4-三唑-1-基	CH ₃
A-406	B-406	1, 2, 4-三唑-3-基	CH ₃

化合物		R ³	R ⁴
A-407	B-407	2-呋喃基	CH ₃
A-408	B-408	3-呋喃基	CH ₃
A-409	B-409	2-噻吩基	CH ₃
A-410	B-410	3-噻吩基	CH ₃
A-411	B-411	2-噻唑基	CH ₃
A-412	B-412	1, 3, 4-噻二唑-2-基	CH ₃
A-413	B-413	3-异噻唑基	CH ₃
A-414	B-414	CH ₃ CO	CH ₃
A-415	B-415	PhCO	CH ₃
A-416	B-416	PhCH ₂ CO	CH ₃
A-417	B-417	CH ₃ SO ₂ NH	CH ₃
A-418	B-418	PhSO ₂ NH	CH ₃
A-419	B-419	CF ₃ CH ₂	CH ₃
A-420	B-420	C1CH ₂ CH ₂	CH ₃
A-421	B-421	C1CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
A-422	B-422	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	CH ₃
A-423	B-423	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	CH ₃
A-424	B-424	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
A-425	B-425	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
A-426	B-426	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
A-427	B-427	(CH ₃ O) ₂ CHCH ₂	CH ₃
A-428	B-428	CH ₃ CONH	CH ₃
A-429	B-429	PhCONH	CH ₃
A-430	B-430	Ph ₂ C=N	CH ₃
A-431	B-431	HOCH ₂ CH ₂	CH ₃
A-432	B-432	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
A-433	B-433	CH ₃ O ₂ CCH ₂	CH ₃
A-434	B-434	CH ₃ O ₂ CCH(CH ₃)	CH ₃
A-435	B-435	CH ₃ O ₂ CC(CH ₃) ₂	CH ₃
A-436	B-436	NCCH ₂	CH ₃
A-437	B-437	NC(CH ₃)(异-C ₃ H ₇)C	CH ₃
A-438	B-438	(1-吡咯烷基)CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
A-439	B-439	CH ₂ =CHCH ₂	C ₂ H ₅
A-440	B-440	CHCCH ₂	C ₂ H ₅
A-441	B-441	CH ₃ CCCH ₂	C ₂ H ₅
A-442	B-442	(环-C ₃ H ₅)CH ₂	C ₂ H ₅
A-443	B-443	PhCH ₂	C ₂ H ₅
A-444	B-444	PhCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
A-445	B-445	(2-C1-Ph)CH ₂	C ₂ H ₅
A-446	B-446	(3-C1-Ph)CH ₂	C ₂ H ₅
A-447	B-447	(4-C1-Ph)CH ₂	C ₂ H ₅
A-448	B-448	(2-CF ₃ -Ph)CH ₂	C ₂ H ₅
A-449	B-449	(3-CF ₃ -Ph)CH ₂	C ₂ H ₅

化合物		R ³	R ⁴
A-450	B-450	(4-CF ₃ -Ph) CH ₂	C ₂ H ₅
A-451	B-451	(2-CH ₃ O-Ph) CH ₂	C ₂ H ₅
A-452	B-452	(3-CH ₃ O-Ph) CH ₂	C ₂ H ₅
A-453	B-453	(4-CH ₃ O-Ph) CH ₂	C ₂ H ₅
A-454	B-454	HO	C ₂ H ₅
A-455	B-455	CH ₃ O	C ₂ H ₅
A-456	B-456	CH ₃ CH ₂ O	C ₂ H ₅
A-457	B-457	正-C ₃ H ₇ O	C ₂ H ₅
A-458	B-458	异-C ₃ H ₇ O	C ₂ H ₅
A-459	B-459	CH ₂ =CHCH ₂ O	C ₂ H ₅
A-460	B-460	CHCCH ₂ O	C ₂ H ₅
A-461	B-461	PhCH ₂ O	C ₂ H ₅
A-462	B-462	PhO	C ₂ H ₅
A-463	B-463	NH ₂	C ₂ H ₅
A-464	B-464	CH ₃ NH	C ₂ H ₅
A-465	B-465	C ₂ H ₅ NH	C ₂ H ₅
A-466	B-466	正-C ₃ H ₇ NH	C ₂ H ₅
A-467	B-467	异-C ₃ H ₇ NH	C ₂ H ₅
A-468	B-468	PhCH ₂ NH	C ₂ H ₅
A-469	B-469	PhNH	C ₂ H ₅
A-470	B-470	2-Cl-PhNH	C ₂ H ₅
A-471	B-471	3-Cl-PhNH	C ₂ H ₅
A-472	B-472	4-Cl-PhNH	C ₂ H ₅
A-473	B-473	2-CF ₃ -PhNH	C ₂ H ₅
A-474	B-474	3-CF ₃ -PhNH	C ₂ H ₅
A-475	B-475	2-CH ₃ O-PhNH	C ₂ H ₅
A-476	B-476	3-CH ₃ O-PhNH	C ₂ H ₅
A-477	B-477	4-CH ₃ O-PhNH	C ₂ H ₅
A-478	B-478	Ph	C ₂ H ₅
A-479	B-479	2-Cl-Ph	C ₂ H ₅
A-480	B-480	3-Cl-Ph	C ₂ H ₅
A-481	B-481	4-Cl-Ph	C ₂ H ₅
A-482	B-482	2-CF ₃ -Ph	C ₂ H ₅
A-483	B-483	3-CF ₃ -Ph	C ₂ H ₅
A-484	B-484	4-CF ₃ -Ph	C ₂ H ₅
A-485	B-485	2-CH ₃ O-Ph	C ₂ H ₅
A-486	B-486	3-CH ₃ O-Ph	C ₂ H ₅
A-487	B-487	4-CH ₃ O-Ph	C ₂ H ₅
A-488	B-488	2-HO-Ph	C ₂ H ₅
A-489	B-489	3-HO-Ph	C ₂ H ₅
A-490	B-490	4-HO-Ph	C ₂ H ₅
A-491	B-491	2-NH ₂ -Ph	C ₂ H ₅
A-492	B-492	3-NH ₂ -Ph	C ₂ H ₅

化合物		R ³	R ⁴
A-493	B-493	4-NH ₂ -Ph	C ₂ H ₅
A-494	B-494	2-HOCH ₂ -Ph	C ₂ H ₅
A-495	B-495	4-CF ₃ O-Ph	C ₂ H ₅
A-496	B-496	4-CF ₃ CH ₂ O-Ph	C ₂ H ₅
A-497	B-497	4-(4-Cl-PhO)-Ph	C ₂ H ₅
A-498	B-498	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	C ₂ H ₅
A-499	B-499	2,3-二氯-Ph	C ₂ H ₅
A-500	B-500	1-吡咯基	C ₂ H ₅
A-501	B-501	1-吡唑基	C ₂ H ₅
A-502	B-502	1,2,4-三唑-1-基	C ₂ H ₅
A-503	B-503	2-噻唑基	C ₂ H ₅
A-504	B-504	1,3,4-噻二唑-2-基	C ₂ H ₅
A-505	B-505	CH ₃ CO	C ₂ H ₅
A-506	B-506	PhCO	C ₂ H ₅
A-507	B-507	PhSO ₂ NH	C ₂ H ₅
A-508	B-508	CF ₃ CH ₂	C ₂ H ₅
A-509	B-509	ClCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
A-510	B-510	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
A-511	B-511	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
A-512	B-512	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
A-513	B-513	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
A-514	B-514	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
A-515	B-515	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
A-516	B-516	(CH ₃ O) ₂ CHCH ₂	C ₂ H ₅
A-517	B-517	CH ₃ CONH	C ₂ H ₅
A-518	B-518	PhCONH	C ₂ H ₅
A-519	B-519	HOCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
A-520	B-520	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
A-521	B-521	CH ₃ O ₂ CCH ₂	C ₂ H ₅
A-522	B-522	CH ₃ O ₂ CCH(CH ₃)	C ₂ H ₅
A-523	B-523	NCCH ₂	正-C ₃ H ₇
A-524	B-524	HOCH ₂ CH ₂	正-C ₃ H ₇
A-525	B-525	CH ₂ =CHCH ₂	异-C ₃ H ₇
A-526	B-526	CHCCH ₂	异-C ₃ H ₇
A-527	B-527	CH ₃ CCCH ₂	异-C ₃ H ₇
A-528	B-528	(环-C ₃ H ₅)CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-529	B-529	PhCH ₂	异-C ₃ H ₇
A-530	B-530	PhCH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-531	B-531	(2-Cl-Ph)CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-532	B-532	(3-Cl-Ph)CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-533	B-533	(4-Cl-Ph)CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-534	B-534	(2-CF ₃ -Ph)CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-535	B-535	(3-CF ₃ -Ph)CH ₂	异-C ₃ H ₇

化合物		R ³	R ⁴
A-536	B-536	(4-CF ₃ -Ph) CH ₂	异-C ₃ H7
A-537	B-537	(2-CH ₃ O-Ph) CH ₂	异-C ₃ H7
A-538	B-538	(3-CH ₃ O-Ph) CH ₂	异-C ₃ H7
A-539	B-539	(4-CH ₃ O-Ph) CH ₂	异-C ₃ H7
A-540	B-540	HO	异-C ₃ H7
A-541	B-541	CH ₃ O	异-C ₃ H7
A-542	B-542	CH ₃ CH ₂ O	异-C ₃ H7
A-543	B-543	正-C ₃ H7O	异-C ₃ H7
A-544	B-544	异-C ₃ H7O	异-C ₃ H7
A-545	B-545	CH ₂ =CHCH ₂ O	异-C ₃ H7
A-546	B-546	CHCCH ₂ O	异-C ₃ H7
A-547	B-547	PhCH ₂ O	异-C ₃ H7
A-548	B-548	PhO	异-C ₃ H7
A-549	B-549	NH ₂	异-C ₃ H7
A-550	B-550	CH ₃ NH	异-C ₃ H7
A-551	B-551	C ₂ H ₅ NH	异-C ₃ H7
A-552	B-552	正-C ₃ H ₇ NH	异-C ₃ H7
A-553	B-553	异-C ₃ H ₇ NH	异-C ₃ H7
A-554	B-554	PhCH ₂ NH	异-C ₃ H7
A-555	B-555	PhNH	异-C ₃ H7
A-556	B-556	2-C1-PhNH	异-C ₃ H7
A-557	B-557	3-C1-PhNH	异-C ₃ H7
A-558	B-558	4-C1-PhNH	异-C ₃ H7
A-559	B-559	2-CF ₃ -PhNH	异-C ₃ H7
A-560	B-560	3-CF ₃ -PhNH	异-C ₃ H7
A-561	B-561	2-CH ₃ O-PhNH	异-C ₃ H7
A-562	B-562	3-CH ₃ O-PhNH	异-C ₃ H7
A-563	B-563	4-CH ₃ O-PhNH	异-C ₃ H7
A-564	B-564	Ph	异-C ₃ H7
A-565	B-565	2-C1-Ph	异-C ₃ H7
A-566	B-566	3-C1-Ph	异-C ₃ H7
A-567	B-567	4-C1-Ph	异-C ₃ H7
A-568	B-568	2-CF ₃ -Ph	异-C ₃ H7
A-569	B-569	3-CF ₃ -Ph	异-C ₃ H7
A-570	B-570	4-CF ₃ -Ph	异-C ₃ H7
A-571	B-571	2-CH ₃ O-Ph	异-C ₃ H7
A-572	B-572	3-CH ₃ O-Ph	异-C ₃ H7
A-573	B-573	4-CH ₃ O-Ph	异-C ₃ H7
A-574	B-574	2-HO-Ph	异-C ₃ H7
A-575	B-575	3-HO-Ph	异-C ₃ H7
A-576	B-576	4-HO-Ph	异-C ₃ H7
A-577	B-577	2-NH ₂ -Ph	异-C ₃ H7
A-578	B-578	3-NH ₂ -Ph	异-C ₃ H7

化合物		R ³	R ⁴
A-579	B-579	4-NH ₂ -Ph	异-C ₃ H ₇
A-580	B-580	2-HOCH ₂ -Ph	异-C ₃ H ₇
A-581	B-581	4-CF ₃ O-Ph	异-C ₃ H ₇
A-582	B-582	4-CF ₃ CH ₂ O-Ph	异-C ₃ H ₇
A-583	B-583	4-(4-C1-PhO)-Ph	异-C ₃ H ₇
A-584	B-584	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	异-C ₃ H ₇
A-585	B-585	2,3-二氯-Ph	异-C ₃ H ₇
A-586	B-586	1-吡咯基	异-C ₃ H ₇
A-587	B-587	1-吡唑基	异-C ₃ H ₇
A-588	B-588	1,2,4-三唑-1-基	异-C ₃ H ₇
A-589	B-589	2-噻唑基	异-C ₃ H ₇
A-590	B-590	1,3,4-噻二唑-2-基	异-C ₃ H ₇
A-591	B-591	CH ₃ CO	异-C ₃ H ₇
A-592	B-592	PhCO	异-C ₃ H ₇
A-593	B-593	PhSO ₂ NH	异-C ₃ H ₇
A-594	B-594	CF ₃ CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-595	B-595	C1CH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-596	B-596	C1CH ₂ CH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-597	B-597	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-598	B-598	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-599	B-599	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-600	B-600	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-601	B-601	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-602	B-602	(CH ₃ O) ₂ CHCH ₂	异-C ₃ H ₇
A-603	B-603	CH ₃ CONH	异-C ₃ H ₇
A-604	B-604	PhCONH	异-C ₃ H ₇
A-605	B-605	HOCH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-606	B-606	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
A-607	B-607	CH ₃ O ₂ CCH ₂	异-C ₃ H ₇
A-608	B-608	CH ₃ O ₂ CCH(CH ₃)	异-C ₃ H ₇
A-609	B-609	NCCH ₂	异-C ₃ H ₇
A-610	B-610	NC(CH ₃)(异-C ₃ H ₇)	叔-C ₄ H ₉
A-611	B-611	CH ₂ =CHCH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-612	B-612	CHCCH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-613	B-613	CH ₃ CCCH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-614	B-614	(环-C ₃ H ₅)CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-615	B-615	PhCH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-616	B-616	PhCH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-617	B-617	(2-C1-Ph)CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-618	B-618	(3-C1-Ph)CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-619	B-619	(4-C1-Ph)CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-620	B-620	(2-CF ₃ -Ph)CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-621	B-621	(3-CF ₃ -Ph)CH ₂	叔-C ₄ H ₉

化合物		R ³	R ⁴
A-622	B-622	(4-CF ₃ -Ph) CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-623	B-623	(2-CH ₃ O-Ph) CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-624	B-624	(3-CH ₃ O-Ph) CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-625	B-625	(4-CH ₃ O-Ph) CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-626	B-626	H ₂ O	叔-C ₄ H ₉
A-627	B-627	CH ₃ O	叔-C ₄ H ₉
A-628	B-628	CH ₃ CH ₂ O	叔-C ₄ H ₉
A-629	B-629	正-C ₃ H ₇ O	叔-C ₄ H ₉
A-630	B-630	异-C ₃ H ₇ O	叔-C ₄ H ₉
A-631	B-631	CH ₂ =CHCH ₂ O	叔-C ₄ H ₉
A-632	B-632	CHCCH ₂ O	叔-C ₄ H ₉
A-633	B-633	PhCH ₂ O	叔-C ₄ H ₉
A-634	B-634	PhO	叔-C ₄ H ₉
A-635	B-635	NH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-636	B-636	CH ₃ NH	叔-C ₄ H ₉
A-637	B-637	C ₂ H ₅ NH	叔-C ₄ H ₉
A-638	B-638	正-C ₃ H ₇ NH	叔-C ₄ H ₉
A-639	B-639	异-C ₃ H ₇ NH	叔-C ₄ H ₉
A-640	B-640	PhCH ₂ NH	叔-C ₄ H ₉
A-641	B-641	PhNH	叔-C ₄ H ₉
A-642	B-642	2-Cl-PhNH	叔-C ₄ H ₉
A-643	B-643	3-Cl-PhNH	叔-C ₄ H ₉
A-644	B-644	4-Cl-PhNH	叔-C ₄ H ₉
A-645	B-645	2-CF ₃ -PhNH	叔-C ₄ H ₉
A-646	B-646	3-CF ₃ -PhNH	叔-C ₄ H ₉
A-647	B-647	2-CH ₃ O-PhNH	叔-C ₄ H ₉
A-648	B-648	3-CH ₃ O-PhNH	叔-C ₄ H ₉
A-649	B-649	4-CH ₃ O-PhNH	叔-C ₄ H ₉
A-650	B-650	Ph	叔-C ₄ H ₉
A-651	B-651	2-Cl-Ph	叔-C ₄ H ₉
A-652	B-652	3-Cl-Ph	叔-C ₄ H ₉
A-653	B-653	4-Cl-Ph	叔-C ₄ H ₉
A-654	B-654	2-CF ₃ -Ph	叔-C ₄ H ₉
A-655	B-655	3-CF ₃ -Ph	叔-C ₄ H ₉
A-656	B-656	4-CF ₃ -Ph	叔-C ₄ H ₉
A-657	B-657	2-CH ₃ O-Ph	叔-C ₄ H ₉
A-658	B-658	3-CH ₃ O-Ph	叔-C ₄ H ₉
A-659	B-659	4-CH ₃ O-Ph	叔-C ₄ H ₉
A-660	B-660	2-HO-Ph	叔-C ₄ H ₉
A-661	B-661	3-HO-Ph	叔-C ₄ H ₉
A-662	B-662	4-HO-Ph	叔-C ₄ H ₉
A-663	B-663	2-NH ₂ -Ph	叔-C ₄ H ₉
A-664	B-664	3-NH ₂ -Ph	叔-C ₄ H ₉

化合物		R ³	R ⁴
A-665	B-665	4-NH ₂ -Ph	叔-C ₄ H ₉
A-666	B-666	2-HOCH ₂ -Ph	叔-C ₄ H ₉
A-667	B-667	4-CF ₃ O-Ph	叔-C ₄ H ₉
A-668	B-668	4-CF ₃ CH ₂ O-Ph	叔-C ₄ H ₉
A-669	B-669	4-(4-Cl-PhO)-Ph	叔-C ₄ H ₉
A-670	B-670	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	叔-C ₄ H ₉
A-671	B-671	2,3-二氯-Ph	叔-C ₄ H ₉
A-672	B-672	1-吡咯基	叔-C ₄ H ₉
A-673	B-673	1-吡唑基	叔-C ₄ H ₉
A-674	B-674	1,2,4-三唑-1-基	叔-C ₄ H ₉
A-675	B-675	2-噻唑基	叔-C ₄ H ₉
A-676	B-676	1,3,4-噻二唑-2-基	叔-C ₄ H ₉
A-677	B-677	CH ₃ CO	叔-C ₄ H ₉
A-678	B-678	PhCO	叔-C ₄ H ₉
A-679	B-679	PhSO ₂ NH	叔-C ₄ H ₉
A-680	B-680	CF ₃ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-681	B-681	ClCH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-682	B-682	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-683	B-683	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-684	B-684	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-685	B-685	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-686	B-686	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-687	B-687	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-688	B-688	(CH ₃ O) ₂ CHCH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-689	B-689	CH ₃ CONH	叔-C ₄ H ₉
A-690	B-690	PhCONH	叔-C ₄ H ₉
A-691	B-691	HOCH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-692	B-692	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-693	B-693	CH ₃ O ₂ CCH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-694	B-694	CH ₃ O ₂ CCH(CH ₃)	叔-C ₄ H ₉
A-695	B-695	NCCH ₂	叔-C ₄ H ₉
A-696	B-696	NC(CH ₃)(异-C ₃ H ₇)C	CH ₂ =CHCH ₂
A-697	B-697	CH ₂ =CHCH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-698	B-698	CHCCH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-699	B-699	CH ₃ CCCH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-700	B-700	(环-C ₃ H ₅)CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-701	B-701	PhCH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-702	B-702	PhCH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-703	B-703	(2-Cl-Ph)CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-704	B-704	(3-Cl-Ph)CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-705	B-705	(4-Cl-Ph)CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-706	B-706	(2-CF ₃ -Ph)CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-707	B-707	(3-CF ₃ -Ph)CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂

化合物		R ³	R ⁴
A-708	B-708	(4-CF ₃ -Ph) CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-709	B-709	(2-CH ₃ O-Ph) CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-710	B-710	(3-CH ₃ O-Ph) CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-711	B-711	(4-CH ₃ O-Ph) CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-712	B-712	H ₂ O	CH ₂ =CHCH ₂
A-713	B-713	CH ₃ O	CH ₂ =CHCH ₂
A-714	B-714	CH ₃ CH ₂ O	CH ₂ =CHCH ₂
A-715	B-715	正-C ₃ H ₇ O	CH ₂ =CHCH ₂
A-716	B-716	异-C ₃ H ₇ O	CH ₂ =CHCH ₂
A-717	B-717	CH ₂ =CHCH ₂ O	CH ₂ =CHCH ₂
A-718	B-718	CHCCH ₂ O	CH ₂ =CHCH ₂
A-719	B-719	PhCH ₂ O	CH ₂ =CHCH ₂
A-720	B-720	PhO	CH ₂ =CHCH ₂
A-721	B-721	NH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-722	B-722	CH ₃ NH	CH ₂ =CHCH ₂
A-723	B-723	C ₂ H ₅ NH	CH ₂ =CHCH ₂
A-724	B-724	正-C ₃ H ₇ NH	CH ₂ =CHCH ₂
A-725	B-725	异-C ₃ H ₇ NH	CH ₂ =CHCH ₂
A-726	B-726	PhCH ₂ NH	CH ₂ =CHCH ₂
A-727	B-727	PhNH	CH ₂ =CHCH ₂
A-728	B-728	2-Cl-PhNH	CH ₂ =CHCH ₂
A-729	B-729	3-Cl-PhNH	CH ₂ =CHCH ₂
A-730	B-730	4-Cl-PhNH	CH ₂ =CHCH ₂
A-731	B-731	2-CF ₃ -PhNH	CH ₂ =CHCH ₂
A-732	B-732	3-CF ₃ -PhNH	CH ₂ =CHCH ₂
A-733	B-733	2-CH ₃ O-PhNH	CH ₂ =CHCH ₂
A-734	B-734	3-CH ₃ O-PhNH	CH ₂ =CHCH ₂
A-735	B-735	4-CH ₃ O-PhNH	CH ₂ =CHCH ₂
A-736	B-736	Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-737	B-737	2-Cl-Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-738	B-738	3-Cl-Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-739	B-739	4-Cl-Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-740	B-740	2-CF ₃ -Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-741	B-741	3-CF ₃ -Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-742	B-742	4-CF ₃ -Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-743	B-743	2-CH ₃ O-Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-744	B-744	3-CH ₃ O-Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-745	B-745	4-CH ₃ O-Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-746	B-746	2-HO-Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-747	B-747	3-HO-Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-748	B-748	4-HO-Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-749	B-749	2-NH ₂ -Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-750	B-750	3-NH ₂ -Ph	CH ₂ =CHCH ₂

化合物		R ³	R ⁴
A-751	B-751	4-NH ₂ -Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-752	B-752	2-HOCH ₂ -Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-753	B-753	4-CF ₃ O-Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-754	B-754	4-CF ₃ CH ₂ O-Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-755	B-755	4-(4-Cl-PhO)-Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-756	B-756	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-757	B-757	2,3-二氯-Ph	CH ₂ =CHCH ₂
A-758	B-758	1-吡咯基	CH ₂ =CHCH ₂
A-759	B-759	1-吡唑基	CH ₂ =CHCH ₂
A-760	B-760	1,2,4-三唑-1-基	CH ₂ =CHCH ₂
A-761	B-761	2-噻唑基	CH ₂ =CHCH ₂
A-762	B-762	1,3,4-噻二唑-2-基	CH ₂ =CHCH ₂
A-763	B-763	CH ₃ CO	CH ₂ =CHCH ₂
A-764	B-764	PhCO	CH ₂ =CHCH ₂
A-765	B-765	PhSO ₂ NH	CH ₂ =CHCH ₂
A-766	B-766	CF ₃ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-767	B-767	ClCH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-768	B-768	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-769	B-769	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-770	B-770	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-771	B-771	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-772	B-772	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-773	B-773	α -C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-774	B-774	(CH ₃ O) ₂ CHCH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-775	B-775	CH ₃ CONH	CH ₂ =CHCH ₂
A-776	B-776	PhCONH	CH ₂ =CHCH ₂
A-777	B-777	HOCH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-778	B-778	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-779	B-779	CH ₃ O ₂ CCH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-780	B-780	CH ₃ O ₂ CCH(CH ₃)	CH ₂ =CHCH ₂
A-781	B-781	NCCH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
A-782	B-782	NC(CH ₃)(异-C ₃ H ₇)C	PhCH ₂
A-783	B-783	CH ₂ =CHCH ₂	PhCH ₂
A-784	B-784	CHCCH ₂	PhCH ₂
A-785	B-785	CH ₃ CCCH ₂	PhCH ₂
A-786	B-786	(环-C ₃ H ₅)CH ₂	PhCH ₂
A-787	B-787	PhCH ₂	PhCH ₂
A-788	B-788	PhCH ₂ CH ₂	PhCH ₂
A-789	B-789	(2-Cl-Ph)CH ₂	PhCH ₂
A-790	B-790	(3-Cl-Ph)CH ₂	PhCH ₂
A-791	B-791	(4-Cl-Ph)CH ₂	PhCH ₂
A-792	B-792	(2-CF ₃ -Ph)CH ₂	PhCH ₂
A-793	B-793	(3-CF ₃ -Ph)CH ₂	PhCH ₂

化合物		R ³	R ⁴
A-794	B-794	(4-CF ₃ -Ph) CH ₂	PhCH ₂
A-795	B-795	(2-CH ₃ O-Ph) CH ₂	PhCH ₂
A-796	B-796	(3-CH ₃ O-Ph) CH ₂	PhCH ₂
A-797	B-797	(4-CH ₃ O-Ph) CH ₂	PhCH ₂
A-798	B-798	HO	PhCH ₂
A-799	B-799	CH ₃ O	PhCH ₂
A-800	B-800	CH ₃ CH ₂ O	PhCH ₂
A-801	B-801	正-C ₃ H ₇ O	PhCH ₂
A-802	B-802	异-C ₃ H ₇ O	PhCH ₂
A-803	B-803	CH ₂ =CHCH ₂ O	PhCH ₂
A-804	B-804	CHCCH ₂ O	PhCH ₂
A-805	B-805	PhCH ₂ O	PhCH ₂
A-806	B-806	PhO	PhCH ₂
A-807	B-807	NH ₂	PhCH ₂
A-808	B-808	CH ₃ NH	PhCH ₂
A-809	B-809	C ₂ H ₅ NH	PhCH ₂
A-810	B-810	正-C ₃ H ₇ NH	PhCH ₂
A-811	B-811	异-C ₃ H ₇ NH	PhCH ₂
A-812	B-812	PhCH ₂ NH	PhCH ₂
A-813	B-813	PhNH	PhCH ₂
A-814	B-814	2-C1-PhNH	PhCH ₂
A-815	B-815	3-C1-PhNH	PhCH ₂
A-816	B-816	4-C1-PhNH	PhCH ₂
A-817	B-817	2-CF ₃ -PhNH	PhCH ₂
A-818	B-818	3-CF ₃ -PhNH	PhCH ₂
A-819	B-819	2-CH ₃ O-PhNH	PhCH ₂
A-820	B-820	3-CH ₃ O-PhNH	PhCH ₂
A-821	B-821	4-CH ₃ O-PhNH	PhCH ₂
A-822	B-822	Ph	PhCH ₂
A-823	B-823	2-C1-Ph	PhCH ₂
A-824	B-824	3-C1-Ph	PhCH ₂
A-825	B-825	4-C1-Ph	PhCH ₂
A-826	B-826	2-CF ₃ -Ph	PhCH ₂
A-827	B-827	3-CF ₃ -Ph	PhCH ₂
A-828	B-828	4-CF ₃ -Ph	PhCH ₂
A-829	B-829	2-CH ₃ O-Ph	PhCH ₂
A-830	B-830	3-CH ₃ O-Ph	PhCH ₂
A-831	B-831	4-CH ₃ O-Ph	PhCH ₂
A-832	B-832	2-HO-Ph	PhCH ₂
A-833	B-833	3-HO-Ph	PhCH ₂
A-834	B-834	4-HO-Ph	PhCH ₂
A-835	B-835	2-NH ₂ -Ph	PhCH ₂
A-836	B-836	3-NH ₂ -Ph	PhCH ₂

化合物		R ³	R ⁴
A-837	B-837	4-NH ₂ -Ph	PhCH ₂
A-838	B-838	2-HOCH ₂ -Ph	PhCH ₂
A-839	B-839	4-CF ₃ O-Ph	PhCH ₂
A-840	B-840	4-CF ₃ CH ₂ O-Ph	PhCH ₂
A-841	B-841	4-(4-Cl-PhO)-Ph	PhCH ₂
A-842	B-842	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph	PhCH ₂
A-843	B-843	2,3-二氯-Ph	PhCH ₂
A-844	B-844	1-吡咯基	PhCH ₂
A-845	B-845	1-吡唑基	PhCH ₂
A-846	B-846	1,2,4-三唑-1-基	PhCH ₂
A-847	B-847	2-噻唑基	PhCH ₂
A-848	B-848	1,3,4-噻二唑-2-基	PhCH ₂
A-849	B-849	CH ₃ CO	PhCH ₂
A-850	B-850	PhCO	PhCH ₂
A-851	B-851	PhSO ₂ NH	PhCH ₂
A-852	B-852	CF ₃ CH ₂	PhCH ₂
A-853	B-853	ClCH ₂ CH ₂	PhCH ₂
A-854	B-854	ClCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
A-855	B-855	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	PhCH ₂
A-856	B-856	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	PhCH ₂
A-857	B-857	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
A-858	B-858	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
A-859	B-859	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
A-860	B-860	(CH ₃ O) ₂ CHCH ₂	PhCH ₂
A-861	B-861	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
A-862	B-862	HOCH ₂ CH ₂	PhCH ₂
A-863	B-863	CH ₂ CHBrCH ₂ CH ₂	
A-864	B-864	CH ₂ CH(OH)CH ₂ CH ₂	
A-865	B-865	CH ₂ CH=CHCH ₂	
A-866	B-866	苯并噻唑-2-基	H
A-867	B-867	Ph	Ph
A-868	B-868	CH ₃ CONH	Ph
A-869	B-869	HOCH ₂ CH ₂	Ph
A-870	B-870	CH ₃ SO ₂ OCH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H
A-871	B-871	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
A-872	B-872	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
A-873	B-873	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	
A-874	B-874	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂	
A-875	B-875	CH ₂ CH ₂ NHCH ₂ CH ₂	
A-876	B-876	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂	
A-877	B-877	N=CHCH ₂ CH ₂	
A-878	B-878	Ph	NH ₂
A-879	B-879	PhCH ₂	(CH ₃) ₂ C=N

化合物		R ³	R ⁴
A-880	B-880	Ph	(CH ₃) ₂ C=N
A-881	B-881	PhCH ₂	H

表 2

式 (I) 化合物, 其中 R¹ 为 -C(=U)NR³R⁴; U 为 O, m 为 0 并且 R² 如下所定义。表 2 中, 化合物 C-1 至 C-151 表示 R² 为甲基的各个化合物; 化合物 D-1 至 D-151 表示 R² 为乙基的各个化合物; 化合物 E-1 至 E-151 表示 R² 为烯丙基的各个化合物; 化合物 F-1 至 F-151 表示 R² 为炔丙基的各个化合物; 化合物 G-1 至 G-151 表示 R² 为苄基的各个化合物; 化合物 H-1 至 H-151 表示 R² 为 -CH₂CO₂CH₃ 的各个化合物; 化合物 I-1 至 I-151 表示 R² 为 -CH(CH₃)CO₂CH₃ 的各个化合物; 化合物 J-1 至 J-151 表示 R² 为 -CH₂CH(OCH₃)₂ 的各个化合物。

化合物								R ³	R ⁴
C-1	D-1	E-1	F-1	G-1	H-1	I-1	J-1	CH ₂ =CHCH ₂	H
C-2	D-2	E-2	F-2	G-2	H-2	I-2	J-2	CH ₃ CH=CHCH ₂	H
C-3	D-3	E-3	F-3	G-3	H-3	I-3	J-3	CH ₂ =CHCH ₂ CH ₂	H
C-4	D-4	E-4	F-4	G-4	H-4	I-4	J-4	CHCCH ₂	H
C-5	D-5	E-5	F-5	G-5	H-5	I-5	J-5	CH ₃ CCCH ₂	H
C-6	D-6	E-6	F-6	G-6	H-6	I-6	J-6	CHCCH(CH ₃)	H
C-7	D-7	E-7	F-7	G-7	H-7	I-7	J-7	环-C ₃ H ₅	H
C-8	D-8	E-8	F-8	G-8	H-8	I-8	J-8	环-C ₅ H ₉	H
C-9	D-9	E-9	F-9	G-9	H-9	I-9	J-9	环-C ₆ H ₁₁	H
C-10	D-10	E-10	F-10	G-10	H-10	I-10	J-10	PhCH ₂	H
C-11	D-11	E-11	F-11	G-11	H-11	I-11	J-11	PhCH(CH ₃)	H
C-12	D-12	E-12	F-12	G-12	H-12	I-12	J-12	NH ₂	H
C-13	D-13	E-13	F-13	G-13	H-13	I-13	J-13	CH ₃ NH	H
C-14	D-14	E-14	F-14	G-14	H-14	I-14	J-14	C ₂ H ₅ NH	H
C-15	D-15	E-15	F-15	G-15	H-15	I-15	J-15	正-C ₃ H ₇ NH	H
C-16	D-16	E-16	F-16	G-16	H-16	I-16	J-16	异-C ₃ H ₇ NH	H
C-17	D-17	E-17	F-17	G-17	H-17	I-17	J-17	正-C ₄ H ₉ NH	H
C-18	D-18	E-18	F-18	G-18	H-18	I-18	J-18	叔-C ₄ H ₉ NH	H
C-19	D-19	E-19	F-19	G-19	H-19	I-19	J-19	正-C ₅ H ₁₁ NH	H
C-20	D-20	E-20	F-20	G-20	H-20	I-20	J-20	正-C ₆ H ₁₃ NH	H
C-21	D-21	E-21	F-21	G-21	H-21	I-21	J-21	PhCH ₂ NH	H
C-22	D-22	E-22	F-22	G-22	H-22	I-22	J-22	PhNH	H
C-23	D-23	E-23	F-23	G-23	H-23	I-23	J-23	HO	H

化合物								R ³	R ⁴
C-24	D-24	E-24	F-24	G-24	H-24	I-24	J-24	CH30	H
C-25	D-25	E-25	F-25	G-25	H-25	I-25	J-25	C2H50	H
C-26	D-26	E-26	F-26	G-26	H-26	I-26	J-26	正-C3H70	H
C-27	D-27	E-27	F-27	G-27	H-27	I-27	J-27	异-C3H70	H
C-28	D-28	E-28	F-28	G-28	H-28	I-28	J-28	正-C4H90	H
C-29	D-29	E-29	F-29	G-29	H-29	I-29	J-29	叔-C4H90	H
C-30	D-30	E-30	F-30	G-30	H-30	I-30	J-30	CH2=CHCH20	H
C-31	D-31	E-31	F-31	G-31	H-31	I-31	J-31	CHCCH20	H
C-32	D-32	E-32	F-32	G-32	H-32	I-32	J-32	CH302CCH20	H
C-33	D-33	E-33	F-33	G-33	H-33	I-33	J-33	CH302CCH(CH3) 0	H
C-34	D-34	E-34	F-34	G-34	H-34	I-34	J-34	CH302CC(CH3) 20	H
C-35	D-35	E-35	F-35	G-35	H-35	I-35	J-35	PhCH20	H
C-36	D-36	E-36	F-36	G-36	H-36	I-36	J-36	Ph	H
C-37	D-37	E-37	F-37	G-37	H-37	I-37	J-37	2-F-Ph	H
C-38	D-38	E-38	F-38	G-38	H-38	I-38	J-38	3-F-Ph	H
C-39	D-39	E-39	F-39	G-39	H-39	I-39	J-39	4-F-Ph	H
C-40	D-40	E-40	F-40	G-40	H-40	I-40	J-40	2-C1-Ph	H
C-41	D-41	E-41	F-41	G-41	H-41	I-41	J-41	3-C1-Ph	H
C-42	D-42	E-42	F-42	G-42	H-42	I-42	J-42	4-C1-Ph	H
C-43	D-43	E-43	F-43	G-43	H-43	I-43	J-43	2-CF3-Ph	H
C-44	D-44	E-44	F-44	G-44	H-44	I-44	J-44	3-CF3-Ph	H
C-45	D-45	E-45	F-45	G-45	H-45	I-45	J-45	4-CF3-Ph	H
C-46	D-46	E-46	F-46	G-46	H-46	I-46	J-46	2-CH3-Ph	H
C-47	D-47	E-47	F-47	G-47	H-47	I-47	J-47	3-CH3-Ph	H
C-48	D-48	E-48	F-48	G-48	H-48	I-48	J-48	4-CH3-Ph	H
C-49	D-49	E-49	F-49	G-49	H-49	I-49	J-49	2-CH30-Ph	H
C-50	D-50	E-50	F-50	G-50	H-50	I-50	J-50	3-CH30-Ph	H
C-51	D-51	E-51	F-51	G-51	H-51	I-51	J-51	4-CH30-Ph	H
C-52	D-52	E-52	F-52	G-52	H-52	I-52	J-52	4-CF30-Ph	H
C-53	D-53	E-53	F-53	G-53	H-53	I-53	J-53	4-CF3CH20-Ph	H
C-54	D-54	E-54	F-54	G-54	H-54	I-54	J-54	4-Ph0-Ph	H
C-55	D-55	E-55	F-55	G-55	H-55	I-55	J-55	4-(4-C1-Ph0)-Ph	H
C-56	D-56	E-56	F-56	G-56	H-56	I-56	J-56	4-(4-CF3-Ph0)-Ph	H
C-57	D-57	E-57	F-57	G-57	H-57	I-57	J-57	CF3CH2	H
C-58	D-58	E-58	F-58	G-58	H-58	I-58	J-58	C1CH2CH2	H
C-59	D-59	E-59	F-59	G-59	H-59	I-59	J-59	C1CH2CH2CH2	H
C-60	D-60	E-60	F-60	G-60	H-60	I-60	J-60	CH30CH2CH2	H
C-61	D-61	E-61	F-61	G-61	H-61	I-61	J-61	CH3CH20CH2CH2	H
C-62	D-62	E-62	F-62	G-62	H-62	I-62	J-62	CH30CH2CH2CH2	H
C-63	D-63	E-63	F-63	G-63	H-63	I-63	J-63	C2H50CH2CH2CH2	H
C-64	D-64	E-64	F-64	G-64	H-64	I-64	J-64	正-C4H90CH2CH2CH2	H
C-65	D-65	E-65	F-65	G-65	H-65	I-65	J-65	CH30CH(CH3)CH2CH2	H

化合物								R ³	R ⁴
C-66	D-66	E-66	F-66	G-66	H-66	I-66	J-66	(CH3O) 2CHCH2	H
C-67	D-67	E-67	F-67	G-67	H-67	I-67	J-67	HOCH2CH2	H
C-68	D-68	E-68	F-68	G-68	H-68	I-68	J-68	HOCH2CH2CH2	H
C-69	D-69	E-69	F-69	G-69	H-69	I-69	J-69	CH3SCH2CH2	H
C-70	D-70	E-70	F-70	G-70	H-70	I-70	J-70	CH3CH2SCH2CH2	H
C-71	D-71	E-71	F-71	G-71	H-71	I-71	J-71	CH3SCH2CH2CH2	H
C-72	D-72	E-72	F-72	G-72	H-72	I-72	J-72	C2H5SCH2CH2CH2	H
C-73	D-73	E-73	F-73	G-73	H-73	I-73	J-73	CH2=CHCH2	CH3
C-74	D-74	E-74	F-74	G-74	H-74	I-74	J-74	CHCCH2	CH3
C-75	D-75	E-75	F-75	G-75	H-75	I-75	J-75	环-C3H5	CH3
C-76	D-76	E-76	F-76	G-76	H-76	I-76	J-76	环-C5H9	CH3
C-77	D-77	E-77	F-77	G-77	H-77	I-77	J-77	环-C6H11	CH3
C-78	D-78	E-78	F-78	G-78	H-78	I-78	J-78	PhCH2	CH3
C-79	D-79	E-79	F-79	G-79	H-79	I-79	J-79	NH2	CH3
C-80	D-80	E-80	F-80	G-80	H-80	I-80	J-80	CH3NH	CH3
C-81	D-81	E-81	F-81	G-81	H-81	I-81	J-81	C2H5NH	CH3
C-82	D-82	E-82	F-82	G-82	H-82	I-82	J-82	PhCH2NH	CH3
C-83	D-83	E-83	F-83	G-83	H-83	I-83	J-83	PhNH	CH3
C-84	D-84	E-84	F-84	G-84	H-84	I-84	J-84	HO	CH3
C-85	D-85	E-85	F-85	G-85	H-85	I-85	J-85	CH3O	CH3
C-86	D-86	E-86	F-86	G-86	H-86	I-86	J-86	C2H5O	CH3
C-87	D-87	E-87	F-87	G-87	H-87	I-87	J-87	CH2=CHCH2O	CH3
C-88	D-88	E-88	F-88	G-88	H-88	I-88	J-88	CHCCH2O	CH3
C-89	D-89	E-89	F-89	G-89	H-89	I-89	J-89	CH3O2CCH2O	CH3
C-90	D-90	E-90	F-90	G-90	H-90	I-90	J-90	CH3O2CCH (CH3) O	CH3
C-91	D-91	E-91	F-91	G-91	H-91	I-91	J-91	PhCH2O	CH3
C-92	D-92	E-92	F-92	G-92	H-92	I-92	J-92	Ph	CH3
C-93	D-93	E-93	F-93	G-93	H-93	I-93	J-93	4-CF3O-Ph	CH3
C-94	D-94	E-94	F-94	G-94	H-94	I-94	J-94	4-(4-CF3O)-Ph	CH3
C-95	D-95	E-95	F-95	G-95	H-95	I-95	J-95	CF3CH2	CH3
C-96	D-96	E-96	F-96	G-96	H-96	I-96	J-96	CH3OCH2CH2	CH3
C-97	D-97	E-97	F-97	G-97	H-97	I-97	J-97	CH3CH2OCH2CH2	CH3
C-98	D-98	E-98	F-98	G-98	H-98	I-98	J-98	CH3OCH2CH2CH2	CH3
C-99	D-99	E-99	F-99	G-99	H-99	I-99	J-99	C2H5OCH2CH2CH2	CH3
C-100	D-100	E-100	F-100	G-100	H-100	I-100	J-100	Δ -C4H9OCH2CH2CH2	CH3
C-101	D-101	E-101	F-101	G-101	H-101	I-101	J-101	(CH3O) 2CHCH2	CH3
C-102	D-102	E-102	F-102	G-102	H-102	I-102	J-102	HOCH2CH2	CH3
C-103	D-103	E-103	F-103	G-103	H-103	I-103	J-103	HOCH2CH2CH2	CH3
C-104	D-104	E-104	F-104	G-104	H-104	I-104	J-104	CH3OCH2CH2CH2	CH3
C-105	D-105	E-105	F-105	G-105	H-105	I-105	J-105	C2H5OCH2CH2CH2	CH3
C-106	D-106	E-106	F-106	G-106	H-106	I-106	J-106	Δ -C4H9OCH2CH2CH2	CH3
C-107	D-107	E-107	F-107	G-107	H-107	I-107	J-107	(CH3O) 2CHCH2	CH3

化合物								R ³	R ⁴
C-108	D-108	E-108	F-108	G-108	H-108	I-108	J-108	HOCH ₂ CH ₂	CH ₃
C-109	D-109	E-109	F-109	G-109	H-109	I-109	J-109	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
C-110	D-110	E-110	F-110	G-110	H-110	I-110	J-110	CH ₂ =CHCH ₂	PhCH ₂
C-111	D-111	E-111	F-111	G-111	H-111	I-111	J-111	CHCCH ₂	PhCH ₂
C-112	D-112	E-112	F-112	G-112	H-112	I-112	J-112	环-C ₃ H ₅	PhCH ₂
C-113	D-113	E-113	F-113	G-113	H-113	I-113	J-113	环-C ₅ H ₉	PhCH ₂
C-114	D-114	E-114	F-114	G-114	H-114	I-114	J-114	环-C ₆ H ₁₁	PhCH ₂
C-115	D-115	E-115	F-115	G-115	H-115	I-115	J-115	NH ₂	PhCH ₂
C-116	D-116	E-116	F-116	G-116	H-116	I-116	J-116	CH ₃ NH	PhCH ₂
C-117	D-117	E-117	F-117	G-117	H-117	I-117	J-117	C ₂ H ₅ NH	PhCH ₂
C-118	D-118	E-118	F-118	G-118	H-118	I-118	J-118	PhNH	PhCH ₂
C-119	D-119	E-119	F-119	G-119	H-119	I-119	J-119	HO	PhCH ₂
C-120	D-120	E-120	F-120	G-120	H-120	I-120	J-120	CH ₃ O	PhCH ₂
C-121	D-121	E-121	F-121	G-121	H-121	I-121	J-121	C ₂ H ₅ O	PhCH ₂
C-122	D-122	E-122	F-122	G-122	H-122	I-122	J-122	CH ₂ =CHCH ₂ O	PhCH ₂
C-123	D-123	E-123	F-123	G-123	H-123	I-123	J-123	CHCCH ₂ O	PhCH ₂
C-124	D-124	E-124	F-124	G-124	H-124	I-124	J-124	CH ₃ O ₂ CCH ₂ O	PhCH ₂
C-125	D-125	E-125	F-125	G-125	H-125	I-125	J-125	CH ₃ O ₂ CCH(CH ₃)O	PhCH ₂
C-126	D-126	E-126	F-126	G-126	H-126	I-126	J-126	PhCH ₂ O	PhCH ₂
C-127	D-127	E-127	F-127	G-127	H-127	I-127	J-127	Ph	PhCH ₂
C-128	D-128	E-128	F-128	G-128	H-128	I-128	J-128	4-CF ₃ O-Ph	PhCH ₂
C-129	D-129	E-129	F-129	G-129	H-129	I-129	J-129	4-(4-CF ₃ O)-Ph	PhCH ₂
C-130	D-130	E-130	F-130	G-130	H-130	I-130	J-130	CF ₃ CH ₂	PhCH ₂
C-131	D-131	E-131	F-131	G-131	H-131	I-131	J-131	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	PhCH ₂
C-132	D-132	E-132	F-132	G-132	H-132	I-132	J-132	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	PhCH ₂
C-133	D-133	E-133	F-133	G-133	H-133	I-133	J-133	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
C-134	D-134	E-134	F-134	G-134	H-134	I-134	J-134	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
C-135	D-135	E-135	F-135	G-135	H-135	I-135	J-135	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
C-136	D-136	E-136	F-136	G-136	H-136	I-136	J-136	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	PhCH ₂
C-137	D-137	E-137	F-137	G-137	H-137	I-137	J-137	HOCH ₂ CH ₂	PhCH ₂
C-138	D-138	E-138	F-138	G-138	H-138	I-138	J-138	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
C-139	D-139	E-139	F-139	G-139	H-139	I-139	J-139	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
C-140	D-140	E-140	F-140	G-140	H-140	I-140	J-140	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
C-141	D-141	E-141	F-141	G-141	H-141	I-141	J-141	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
C-142	D-142	E-142	F-142	G-142	H-142	I-142	J-142	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	PhCH ₂
C-143	D-143	E-143	F-143	G-143	H-143	I-143	J-143	HOCH ₂ CH ₂	PhCH ₂
C-144	D-144	E-144	F-144	G-144	H-144	I-144	J-144	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
C-145	D-145	E-145	F-145	G-145	H-145	I-145	J-145	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
C-146	D-146	E-146	F-146	G-146	H-146	I-146	J-146	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
C-147	D-147	E-147	F-147	G-147	H-147	I-147	J-147	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	
C-148	D-148	E-148	F-148	G-148	H-148	I-148	J-148	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂	
C-149	D-149	E-149	F-149	G-149	H-149	I-149	J-149	CH ₂ CH ₂ NHCH ₂ CH ₂	

化合物								R ³	R ⁴
C-150	D-150	E-150	F-150	G-150	H-150	I-150	J-150	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂	
C-151	D-151	E-151	F-151	G-151	H-151	I-151	J-151	N=CHCH ₂ CH ₂	

表 3

式 (I) 化合物, 其中 R¹ 为 -C(=U)NR³R⁴; U 为 S, m 为 0。表 3 中, 化合物 K-1 至 K-151 表示 R² 为甲基的各个化合物; 化合物 L-1 至 L-151 表示 R² 为乙基的各个化合物; 化合物 M-1 至 M-151 表示 R² 为烯丙基的各个化合物; 化合物 N-1 至 N-151 表示 R² 为炔丙基的各个化合物; 化合物 O-1 至 O-151 表示 R² 为苄基的各个化合物; 化合物 P-1 至 P-151 表示 R² 为 -CH₂CO₂CH₃ 的各个化合物; 化合物 Q-1 至 Q-151 表示 R² 为 -CH(CH₃)CO₂CH₃ 的各个化合物; 化合物 R-1 至 R-151 表示 R² 为 -CH₂CH(OCH₃)₂ 的各个化合物。

化合物								R ³	R ⁴
K-1	L-1	M-1	N-1	O-1	P-1	Q-1	R-1	CH ₂ =CHCH ₂	H
K-2	L-2	M-2	N-2	O-2	P-2	Q-2	R-2	CH ₃ CH=CHCH ₂	H
K-3	L-3	M-3	N-3	O-3	P-3	Q-3	R-3	CH ₂ =CHCH ₂ CH ₂	H
K-4	L-4	M-4	N-4	O-4	P-4	Q-4	R-4	CHCCH ₂	H
K-5	L-5	M-5	N-5	O-5	P-5	Q-1	R-5	CH ₃ CCCH ₂	H
K-6	L-6	M-6	N-6	O-6	P-6	Q-2	R-6	CHCCH(CH ₃)	H
K-7	L-7	M-7	N-7	O-7	P-7	Q-3	R-7	环-C ₃ H ₅	H
K-8	L-8	M-8	N-8	O-8	P-8	Q-4	R-8	环-C ₅ H ₉	H
K-9	L-9	M-9	N-9	O-9	P-9	Q-1	R-9	环-C ₆ H ₁₁	H
K-10	L-10	M-10	N-10	O-10	P-10	Q-2	R-10	PhCH ₂	H
K-11	L-11	M-11	N-11	O-11	P-11	Q-3	R-11	PhCH(CH ₃)	H
K-12	L-12	M-12	N-12	O-12	P-12	Q-4	R-12	NH ₂	H
K-13	L-13	M-13	N-13	O-13	P-13	Q-1	R-13	CH ₃ NH	H
K-14	L-14	M-14	N-14	O-14	P-14	Q-2	R-14	C ₂ H ₅ NH	H
K-15	L-15	M-15	N-15	O-15	P-15	Q-3	R-15	正-C ₃ H ₇ NH	H
K-16	L-16	M-16	N-16	O-16	P-16	Q-4	R-16	异-C ₃ H ₇ NH	H
K-17	L-17	M-17	N-17	O-17	P-17	Q-1	R-17	正-C ₄ H ₉ NH	H
K-18	L-18	M-18	N-18	O-18	P-18	Q-2	R-18	叔-C ₄ H ₉ NH	H
K-19	L-19	M-19	N-19	O-19	P-19	Q-3	R-19	正-C ₅ H ₁₁ NH	H
K-20	L-20	M-20	N-20	O-20	P-20	Q-4	R-20	正-C ₆ H ₁₃ NH	H
K-21	L-21	M-21	N-21	O-21	P-21	Q-1	R-21	PhCH ₂ NH	H
K-22	L-22	M-22	N-22	O-22	P-22	Q-2	R-22	PhNH	H
K-23	L-23	M-23	N-23	O-23	P-23	Q-3	R-23	HO	H

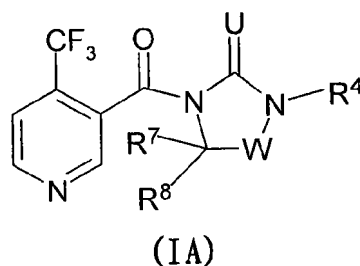
K-24	L-24	M-24	N-24	O-24	P-24	Q-4	R-24	CH3O	H
K-25	L-25	M-25	N-25	O-25	P-25	Q-1	R-25	C2H5O	H
K-26	L-26	M-26	N-26	O-26	P-26	Q-2	R-26	正-C3H7O	H
K-27	L-27	M-27	N-27	O-27	P-27	Q-3	R-27	异-C3H7O	H
K-28	L-28	M-28	N-28	O-28	P-28	Q-4	R-28	正-C4H9O	H
K-29	L-29	M-29	N-29	O-29	P-29	Q-1	R-29	叔-C4H9O	H
K-30	L-30	M-30	N-30	O-30	P-30	Q-2	R-30	CH2=CHCH2O	H
K-31	L-31	M-31	N-31	O-31	P-31	Q-3	R-31	CHCCH2O	H
K-32	L-32	M-32	N-32	O-32	P-32	Q-4	R-32	CH3O2CCH2O	H
K-33	L-33	M-33	N-33	O-33	P-33	Q-1	R-33	CH3O2CCH(CH3)O	H
K-34	L-34	M-34	N-34	O-34	P-34	Q-2	R-34	CH3O2CC(CH3)2O	H
K-35	L-35	M-35	N-35	O-35	P-35	Q-3	R-35	PhCH2O	H
K-36	L-36	M-36	N-36	O-36	P-36	Q-4	R-36	Ph	H
K-37	L-37	M-37	N-37	O-37	P-37	Q-1	R-37	2-F-Ph	H
K-38	L-38	M-38	N-38	O-38	P-38	Q-2	R-38	3-F-Ph	H
K-39	L-39	M-39	N-39	O-39	P-39	Q-3	R-39	4-F-Ph	H
K-40	L-40	M-40	N-40	O-40	P-40	Q-4	R-40	2-Cl-Ph	H
K-41	L-41	M-41	N-41	O-41	P-41	Q-1	R-41	3-Cl-Ph	H
K-42	L-42	M-42	N-42	O-42	P-42	Q-2	R-42	4-Cl-Ph	H
K-43	L-43	M-43	N-43	O-43	P-43	Q-3	R-43	2-CF3-Ph	H
K-44	L-44	M-44	N-44	O-44	P-44	Q-4	R-44	3-CF3-Ph	H
K-45	L-45	M-45	N-45	O-45	P-45	Q-1	R-45	4-CF3-Ph	H
K-46	L-46	M-46	N-46	O-46	P-46	Q-2	R-46	2-CH3-Ph	H
K-47	L-47	M-47	N-47	O-47	P-47	Q-3	R-47	3-CH3-Ph	H
K-48	L-48	M-48	N-48	O-48	P-48	Q-4	R-48	4-CH3-Ph	H
K-49	L-49	M-49	N-49	O-49	P-49	Q-1	R-49	2-CH3O-Ph	H
K-50	L-50	M-50	N-50	O-50	P-50	Q-2	R-50	3-CH3O-Ph	H
K-51	L-51	M-51	N-51	O-51	P-51	Q-3	R-51	4-CH3O-Ph	H
K-52	L-52	M-52	N-52	O-52	P-52	Q-4	R-52	4-CF3O-Ph	H
K-53	L-53	M-53	N-53	O-53	P-53	Q-1	R-53	4-CF3CH2O-Ph	H
K-54	L-54	M-54	N-54	O-54	P-54	Q-2	R-54	4-PhO-Ph	H
K-55	L-55	M-55	N-55	O-55	P-55	Q-3	R-55	4-(4-Cl-PhO)-Ph	H
K-56	L-56	M-56	N-56	O-56	P-56	Q-4	R-56	4-(4-CF3-PhO)-Ph	H
K-57	L-57	M-57	N-57	O-57	P-57	Q-1	R-57	CF3CH2	H
K-58	L-58	M-58	N-58	O-58	P-58	Q-2	R-58	C1CH2CH2	H
K-59	L-59	M-59	N-59	O-59	P-59	Q-3	R-59	C1CH2CH2CH2	H
K-60	L-60	M-60	N-60	O-60	P-60	Q-4	R-60	CH3OCH2CH2	H
K-61	L-61	M-61	N-61	O-61	P-61	Q-1	R-61	CH3CH2OCH2CH2	H
K-62	L-62	M-62	N-62	O-62	P-62	Q-2	R-62	CH3OCH2CH2CH2	H
K-63	L-63	M-63	N-63	O-63	P-63	Q-3	R-63	C2H5OCH2CH2CH2	H
K-64	L-64	M-64	N-64	O-64	P-64	Q-4	R-64	正-C4H9OCH2CH2CH2	H
K-65	L-65	M-65	N-65	O-65	P-65	Q-1	R-65	CH3OCH(CH3)CH2CH2	H
K-66	L-66	M-66	N-66	O-66	P-66	Q-2	R-66	(CH3O)2CHCH2	H

K-67	L-67	M-67	N-67	O-67	P-67	Q-3	R-67	HOCH ₂ CH ₂	H
K-68	L-68	M-68	N-68	O-68	P-68	Q-4	R-68	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
K-69	L-69	M-69	N-69	O-69	P-69	Q-1	R-69	CH ₃ SCH ₂ CH ₂	H
K-70	L-70	M-70	N-70	O-70	P-70	Q-2	R-70	CH ₃ CH ₂ SCH ₂ CH ₂	H
K-71	L-71	M-71	N-71	O-71	P-71	Q-3	R-71	CH ₃ SCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
K-72	L-72	M-72	N-72	O-72	P-72	Q-4	R-72	C ₂ H ₅ SCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
K-73	L-73	M-73	N-73	O-73	P-73	Q-1	R-73	CH ₂ =CHCH ₂	CH ₃
K-74	L-74	M-74	N-74	O-74	P-74	Q-2	R-74	CHCCH ₂	CH ₃
K-75	L-75	M-75	N-75	O-75	P-75	Q-3	R-75	环-C ₃ H ₅	CH ₃
K-76	L-76	M-76	N-76	O-76	P-76	Q-4	R-76	环-C ₅ H ₉	CH ₃
K-77	L-77	M-77	N-77	O-77	P-77	Q-1	R-77	环-C ₆ H ₁₁	CH ₃
K-78	L-78	M-78	N-78	O-78	P-78	Q-2	R-78	PhCH ₂	CH ₃
K-79	L-79	M-79	N-79	O-79	P-79	Q-3	R-79	NH ₂	CH ₃
K-80	L-80	M-80	N-80	O-80	P-80	Q-4	R-80	CH ₃ NH	CH ₃
K-81	L-81	M-81	N-81	O-81	P-81	Q-1	R-81	C ₂ H ₅ NH	CH ₃
K-82	L-82	M-82	N-82	O-82	P-82	Q-2	R-82	PhCH ₂ NH	CH ₃
K-83	L-83	M-83	N-83	O-83	P-83	Q-3	R-83	PhNH	CH ₃
K-84	L-84	M-84	N-84	O-84	P-84	Q-4	R-84	HO	CH ₃
K-85	L-85	M-85	N-85	O-85	P-85	Q-1	R-85	CH ₃ O	CH ₃
K-86	L-86	M-86	N-86	O-86	P-86	Q-2	R-86	C ₂ H ₅ O	CH ₃
K-87	L-87	M-87	N-87	O-87	P-87	Q-3	R-87	CH ₂ =CHCH ₂ O	CH ₃
K-88	L-88	M-88	N-88	O-88	P-88	Q-4	R-88	CHCCH ₂ O	CH ₃
K-89	L-89	M-89	N-89	O-89	P-89	Q-1	R-89	CH ₃ O ₂ CCH ₂ O	CH ₃
K-90	L-90	M-90	N-90	O-90	P-90	Q-2	R-90	CH ₃ O ₂ CCH(CH ₃)O	CH ₃
K-91	L-91	M-91	N-91	O-91	P-91	Q-3	R-91	PhCH ₂ O	CH ₃
K-92	L-92	M-92	N-92	O-92	P-92	Q-4	R-92	Ph	CH ₃
K-93	L-93	M-93	N-93	O-93	P-93	Q-1	R-93	4-CF ₃ O-Ph	CH ₃
K-94	L-94	M-94	N-94	O-94	P-94	Q-2	R-94	4-(4-CF ₃ O)-Ph	CH ₃
K-95	L-95	M-95	N-95	O-95	P-95	Q-3	R-95	CF ₃ CH ₂	CH ₃
K-96	L-96	M-96	N-96	O-96	P-96	Q-4	R-96	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	CH ₃
K-97	L-97	M-97	N-97	O-97	P-97	Q-1	R-97	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	CH ₃
K-98	L-98	M-98	N-98	O-98	P-98	Q-2	R-98	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
K-99	L-99	M-99	N-99	O-99	P-99	Q-3	R-99	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
K-100	L-100	M-100	N-100	O-100	P-100	Q-4	R-100	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
K-101	L-101	M-101	N-101	O-101	P-101	Q-1	R-101	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	CH ₃
K-102	L-102	M-102	N-102	O-102	P-102	Q-2	R-102	HOCH ₂ CH ₂	CH ₃
K-103	L-103	M-103	N-103	O-103	P-103	Q-3	R-103	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
K-104	L-104	M-104	N-104	O-104	P-104	Q-4	R-104	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
K-105	L-105	M-105	N-105	O-105	P-105	Q-1	R-105	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
K-106	L-106	M-106	N-106	O-106	P-106	Q-2	R-106	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
K-107	L-107	M-107	N-107	O-107	P-107	Q-3	R-107	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	CH ₃
K-108	L-108	M-108	N-108	O-108	P-108	Q-4	R-108	HOCH ₂ CH ₂	CH ₃
K-109	L-109	M-109	N-109	O-109	P-109	Q-1	R-109	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃

K-110	L-110	M-110	N-110	O-110	P-110	Q-2	R-110	CH ₂ =CHCH ₂	PhCH ₂
K-111	L-111	M-111	N-111	O-111	P-111	Q-3	R-111	CHCCH ₂	PhCH ₂
K-112	L-112	M-112	N-112	O-112	P-112	Q-4	R-112	环-C ₃ H ₅	PhCH ₂
K-113	L-113	M-113	N-113	O-113	P-113	Q-1	R-113	环-C ₅ H ₉	PhCH ₂
K-114	L-114	M-114	N-114	O-114	P-114	Q-2	R-114	环-C ₆ H ₁₁	PhCH ₂
K-115	L-115	M-115	N-115	O-115	P-115	Q-3	R-115	NH ₂	PhCH ₂
K-116	L-116	M-116	N-116	O-116	P-116	Q-4	R-116	CH ₃ NH	PhCH ₂
K-117	L-117	M-117	N-117	O-117	P-117	Q-1	R-117	C ₂ H ₅ NH	PhCH ₂
K-118	L-118	M-118	N-118	O-118	P-118	Q-2	R-118	PhNH	PhCH ₂
K-119	L-119	M-119	N-119	O-119	P-119	Q-3	R-119	HO	PhCH ₂
K-120	L-120	M-120	N-120	O-120	P-120	Q-4	R-120	CH ₃ O	PhCH ₂
K-121	L-121	M-121	N-121	O-121	P-121	Q-1	R-121	C ₂ H ₅ O	PhCH ₂
K-122	L-122	M-122	N-122	O-122	P-122	Q-2	R-122	CH ₂ =CHCH ₂ O	PhCH ₂
K-123	L-123	M-123	N-123	O-123	P-123	Q-3	R-123	CHCCH ₂ O	PhCH ₂
K-124	L-124	M-124	N-124	O-124	P-124	Q-4	R-124	CH ₃ O ₂ CCH ₂ O	PhCH ₂
K-125	L-125	M-125	N-125	O-125	P-125	Q-1	R-125	CH ₃ O ₂ CCH(CH ₃)O	PhCH ₂
K-126	L-126	M-126	N-126	O-126	P-126	Q-2	R-126	PhCH ₂ O	PhCH ₂
K-127	L-127	M-127	N-127	O-127	P-127	Q-3	R-127	Ph	PhCH ₂
K-128	L-128	M-128	N-128	O-128	P-128	Q-4	R-128	4-CF ₃ O-Ph	PhCH ₂
K-129	L-129	M-129	N-129	O-129	P-129	Q-1	R-129	4-(4-CF ₃ O)-Ph	PhCH ₂
K-130	L-130	M-130	N-130	O-130	P-130	Q-2	R-130	CF ₃ CH ₂	PhCH ₂
K-131	L-131	M-131	N-131	O-131	P-131	Q-3	R-131	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	PhCH ₂
K-132	L-132	M-132	N-132	O-132	P-132	Q-4	R-132	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	PhCH ₂
K-133	L-133	M-133	N-133	O-133	P-133	Q-1	R-133	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
K-134	L-134	M-134	N-134	O-134	P-134	Q-2	R-134	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
K-135	L-135	M-135	N-135	O-135	P-135	Q-3	R-135	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
K-136	L-136	M-136	N-136	O-136	P-136	Q-4	R-136	(CH ₃ O) ₂ CHCH ₂	PhCH ₂
K-137	L-137	M-137	N-137	O-137	P-137	Q-1	R-137	HOCH ₂ CH ₂	PhCH ₂
K-138	L-138	M-138	N-138	O-138	P-138	Q-2	R-138	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
K-139	L-139	M-139	N-139	O-139	P-139	Q-3	R-139	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
K-140	L-140	M-140	N-140	O-140	P-140	Q-4	R-140	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
K-141	L-141	M-141	N-141	O-141	P-141	Q-1	R-141	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
K-142	L-142	M-142	N-142	O-142	P-142	Q-2	R-142	(CH ₃ O) ₂ CHCH ₂	PhCH ₂
K-143	L-143	M-143	N-143	O-143	P-143	Q-3	R-143	HOCH ₂ CH ₂	PhCH ₂
K-144	L-144	M-144	N-144	O-144	P-144	Q-4	R-144	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
K-145	L-145	M-145	N-145	O-145	P-145	Q-1	R-145	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
K-146	L-146	M-146	N-146	O-146	P-146	Q-2	R-146	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂	
K-147	L-147	M-147	N-147	O-147	P-147	Q-3	R-147	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	
K-148	L-148	M-148	N-148	O-148	P-148	Q-4	R-148	CH ₂ CH ₂ SCCH ₂ CH ₂	
K-149	L-149	M-149	N-149	O-149	P-149	Q-1	R-149	CH ₂ CH ₂ NHCH ₂ CH ₂	
K-150	L-150	M-150	N-150	O-150	P-150	Q-2	R-150	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂	
K-151	L-151	M-151	N-151	O-151	P-151	Q-3	R-151	N=CHCH ₂ CH ₂	

表 4

式 (IA) 化合物:



化合物	U	R ⁷	R ⁸	W	R ⁴
S-1	0	H	H	CH ₂	H
S-2	0	H	H	CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-3	0	H	H	CH ₂	异-C ₃ H ₇
S-4	0	H	H	CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-5	0	H	H	CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-6	0	H	H	CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-7	0	H	H	CH ₂	叔-C ₄ H ₉
S-8	0	H	H	CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-9	0	H	H	CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-10	0	H	H	CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-11	0	H	H	CH ₂	环-C ₅ H ₉
S-12	0	H	H	CH ₂	环-C ₆ H ₁₁
S-13	0	H	H	CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-14	0	H	H	CH ₂	CHCCH ₂
S-15	0	H	H	CH ₂	PhCH ₂
S-16	0	H	H	CH ₂	Ph (CH ₃) CH
S-17	0	H	H	CH ₂	Ph (CH ₃) ₂ C
S-18	0	H	H	CH ₂	Ph
S-19	0	H	H	CH ₂	2-C ₁ -Ph
S-20	0	H	H	CH ₂	3-C ₁ -Ph
S-21	0	H	H	CH ₂	4-C ₁ -Ph
S-22	0	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-Ph
S-23	0	H	H	CH ₂	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-24	0	CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅
S-25	0	CH ₃	H	CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-26	0	CH ₃	H	CH ₂	异-C ₃ H ₇
S-27	0	CH ₃	H	CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-28	0	CH ₃	H	CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-29	0	CH ₃	H	CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-30	0	CH ₃	H	CH ₂	叔-C ₄ H ₉
S-31	0	CH ₃	H	CH ₂	正-C ₅ H ₁₁

化合物	U	R ⁷	R ⁸	W	R ⁴
S-32	0	CH3	H	CH2	正-C6H13
S-33	0	CH3	H	CH2	环-C3H5
S-34	0	CH3	H	CH2	环-C5H9
S-35	0	CH3	H	CH2	环-C6H11
S-36	0	CH3	H	CH2	CH2=CHCH2
S-37	0	CH3	H	CH2	CHCCH2
S-38	0	CH3	H	CH2	PhCH2
S-39	0	CH3	H	CH2	Ph (CH3) CH
S-40	0	CH3	H	CH2	Ph (CH3) 2C
S-41	0	CH3	H	CH2	Ph
S-42	0	CH3	H	CH2	2-C1-Ph
S-43	0	CH3	H	CH2	3-C1-Ph
S-44	0	CH3	H	CH2	4-C1-Ph
S-45	0	CH3	H	CH2	4-CF30-Ph
S-46	0	CH3	H	CH2	4-(4-CF3-Ph0)-Ph
S-47	0	CH3	CH3	CH2	CH3
S-48	0	CH3	CH3	CH2	C2H5
S-49	0	CH3	CH3	CH2	正-C3H7
S-50	0	CH3	CH3	CH2	异-C3H7
S-51	0	CH3	CH3	CH2	正-C4H9
S-52	0	CH3	CH3	CH2	异-C4H9
S-53	0	CH3	CH3	CH2	仲-C4H9
S-54	0	CH3	CH3	CH2	叔-C4H9
S-55	0	CH3	CH3	CH2	正-C5H11
S-56	0	CH3	CH3	CH2	正-C6H13
S-57	0	CH3	CH3	CH2	环-C3H5
S-58	0	CH3	CH3	CH2	环-C5H9
S-59	0	CH3	CH3	CH2	环-C6H11
S-60	0	CH3	CH3	CH2	CH2=CHCH2
S-61	0	CH3	CH3	CH2	CHCCH2
S-62	0	CH3	CH3	CH2	PhCH2
S-63	0	CH3	CH3	CH2	Ph (CH3) CH
S-64	0	CH3	CH3	CH2	Ph (CH3) 2C
S-65	0	CH3	CH3	CH2	Ph
S-66	0	CH3	CH3	CH2	2-C1-Ph
S-67	0	CH3	CH3	CH2	3-C1-Ph
S-68	0	CH3	CH3	CH2	4-C1-Ph
S-69	0	CH3	CH3	CH2	4-CF30-Ph
S-70	0	CH3	CH3	CH2	4-(4-CF3-Ph0)-Ph
S-71	0	OCH3	H	CH2	C2H5
S-72	0	OCH3	H	CH2	正-C3H7
S-73	0	OCH3	H	CH2	异-C3H7

化合物	U	R ⁷	R ⁸	W	R ⁴
S-74	0	OCH ₃	H	CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-75	0	OCH ₃	H	CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-76	0	OCH ₃	H	CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-77	0	OCH ₃	H	CH ₂	叔-C ₄ H ₉
S-78	0	OCH ₃	H	CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-79	0	OCH ₃	H	CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-80	0	OCH ₃	H	CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-81	0	OCH ₃	H	CH ₂	环-C ₅ H ₉
S-82	0	OCH ₃	H	CH ₂	环-C ₆ H ₁₁
S-83	0	OCH ₃	H	CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-84	0	OCH ₃	H	CH ₂	CHCCH ₂
S-85	0	OCH ₃	H	CH ₂	PhCH ₂
S-86	0	OCH ₃	H	CH ₂	Ph (CH ₃) CH
S-87	0	OCH ₃	H	CH ₂	Ph (CH ₃) 2C
S-88	0	OCH ₃	H	CH ₂	Ph
S-89	0	OCH ₃	H	CH ₂	2-C ₁ -Ph
S-90	0	OCH ₃	H	CH ₂	3-C ₁ -Ph
S-91	0	OCH ₃	H	CH ₂	4-C ₁ -Ph
S-92	0	OCH ₃	H	CH ₂	4-CF ₃ O-Ph
S-93	0	OCH ₃	H	CH ₂	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-94	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	CH ₃
S-95	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅
S-96	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-97	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	异-C ₃ H ₇
S-98	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-99	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-100	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-101	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	叔-C ₄ H ₉
S-102	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-103	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-104	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-105	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	环-C ₅ H ₉
S-106	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	环-C ₆ H ₁₁
S-107	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-108	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	CHCCH ₂
S-109	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	PhCH ₂
S-110	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	Ph (CH ₃) CH
S-111	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	Ph (CH ₃) 2C
S-112	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	Ph
S-113	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	2-C ₁ -Ph
S-114	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	3-C ₁ -Ph
S-115	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	4-C ₁ -Ph

化合物	U	R ⁷	R ⁸	W	R ⁴
S-116	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	4-CF ₃ O-Ph
S-117	0	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-118	0	H	H	C=O	H
S-119	0	H	H	C=O	正-C ₃ H ₇
S-120	0	H	H	C=O	异-C ₃ H ₇
S-121	0	H	H	C=O	正-C ₄ H ₉
S-122	0	H	H	C=O	异-C ₄ H ₉
S-123	0	H	H	C=O	仲-C ₄ H ₉
S-124	0	H	H	C=O	叔-C ₄ H ₉
S-125	0	H	H	C=O	正-C ₅ H ₁₁
S-126	0	H	H	C=O	正-C ₆ H ₁₃
S-127	0	H	H	C=O	环-C ₃ H ₅
S-128	0	H	H	C=O	环-C ₅ H ₉
S-129	0	H	H	C=O	环-C ₆ H ₁₁
S-130	0	H	H	C=O	CH ₂ =CHCH ₂
S-131	0	H	H	C=O	CHCCH ₂
S-132	0	H	H	C=O	PhCH ₂
S-133	0	H	H	C=O	Ph(CH ₃)CH
S-134	0	H	H	C=O	Ph(CH ₃) ₂ C
S-135	0	H	H	C=O	Ph
S-136	0	H	H	C=O	2-C ₁ -Ph
S-137	0	H	H	C=O	3-C ₁ -Ph
S-138	0	H	H	C=O	4-C ₁ -Ph
S-139	0	H	H	C=O	4-CF ₃ O-Ph
S-140	0	H	H	C=O	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-141	0	CH ₃	H	C=O	C ₂ H ₅
S-142	0	CH ₃	H	C=O	正-C ₃ H ₇
S-143	0	CH ₃	H	C=O	异-C ₃ H ₇
S-144	0	CH ₃	H	C=O	正-C ₄ H ₉
S-145	0	CH ₃	H	C=O	异-C ₄ H ₉
S-146	0	CH ₃	H	C=O	仲-C ₄ H ₉
S-147	0	CH ₃	H	C=O	叔-C ₄ H ₉
S-148	0	CH ₃	H	C=O	正-C ₅ H ₁₁
S-149	0	CH ₃	H	C=O	正-C ₆ H ₁₃
S-150	0	CH ₃	H	C=O	环-C ₃ H ₅
S-151	0	CH ₃	H	C=O	环-C ₅ H ₉
S-152	0	CH ₃	H	C=O	环-C ₆ H ₁₁
S-153	0	CH ₃	H	C=O	CH ₂ =CHCH ₂
S-154	0	CH ₃	H	C=O	CHCCH ₂
S-155	0	CH ₃	H	C=O	PhCH ₂
S-156	0	CH ₃	H	C=O	Ph(CH ₃)CH
S-157	0	CH ₃	H	C=O	Ph(CH ₃) ₂ C

化合物	U	R ⁷	R ⁸	W	R ⁴
S-158	0	CH ₃	H	C=O	Ph
S-159	0	CH ₃	H	C=O	2-C1-Ph
S-160	0	CH ₃	H	C=O	3-C1-Ph
S-161	0	CH ₃	H	C=O	4-C1-Ph
S-162	0	CH ₃	H	C=O	4-CF ₃ O-Ph
S-163	0	CH ₃	H	C=O	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-164	0	CH ₃	CH ₃	C=O	CH ₃
S-165	0	CH ₃	CH ₃	C=O	C ₂ H ₅
S-166	0	CH ₃	CH ₃	C=O	正-C ₃ H ₇
S-167	0	CH ₃	CH ₃	C=O	异-C ₃ H ₇
S-168	0	CH ₃	CH ₃	C=O	正-C ₄ H ₉
S-169	0	CH ₃	CH ₃	C=O	异-C ₄ H ₉
S-170	0	CH ₃	CH ₃	C=O	仲-C ₄ H ₉
S-171	0	CH ₃	CH ₃	C=O	叔-C ₄ H ₉
S-172	0	CH ₃	CH ₃	C=O	正-C ₅ H ₁₁
S-173	0	CH ₃	CH ₃	C=O	正-C ₆ H ₁₃
S-174	0	CH ₃	CH ₃	C=O	环-C ₃ H ₅
S-175	0	CH ₃	CH ₃	C=O	环-C ₅ H ₉
S-176	0	CH ₃	CH ₃	C=O	环-C ₆ H ₁₁
S-177	0	CH ₃	CH ₃	C=O	CH ₂ =CHCH ₂
S-178	0	CH ₃	CH ₃	C=O	CHCCH ₂
S-179	0	CH ₃	CH ₃	C=O	PhCH ₂
S-180	0	CH ₃	CH ₃	C=O	Ph(CH ₃)CH
S-181	0	CH ₃	CH ₃	C=O	Ph(CH ₃) ₂ C
S-182	0	CH ₃	CH ₃	C=O	Ph
S-183	0	CH ₃	CH ₃	C=O	2-C1-Ph
S-184	0	CH ₃	CH ₃	C=O	3-C1-Ph
S-185	0	CH ₃	CH ₃	C=O	4-C1-Ph
S-186	0	CH ₃	CH ₃	C=O	4-CF ₃ O-Ph
S-187	0	CH ₃	CH ₃	C=O	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-188	0	OCH ₃	H	C=O	C ₂ H ₅
S-189	0	OCH ₃	H	C=O	正-C ₃ H ₇
S-190	0	OCH ₃	H	C=O	异-C ₃ H ₇
S-191	0	OCH ₃	H	C=O	正-C ₄ H ₉
S-192	0	OCH ₃	H	C=O	异-C ₄ H ₉
S-193	0	OCH ₃	H	C=O	仲-C ₄ H ₉
S-194	0	OCH ₃	H	C=O	叔-C ₄ H ₉
S-195	0	OCH ₃	H	C=O	正-C ₅ H ₁₁
S-196	0	OCH ₃	H	C=O	正-C ₆ H ₁₃
S-197	0	OCH ₃	H	C=O	环-C ₃ H ₅
S-198	0	OCH ₃	H	C=O	环-C ₅ H ₉
S-199	0	OCH ₃	H	C=O	环-C ₆ H ₁₁

化合物	U	R ⁷	R ⁸	W	R ⁴
S-200	0	OCH ₃	H	C=O	CH ₂ =CHCH ₂
S-201	0	OCH ₃	H	C=O	CHCCH ₂
S-202	0	OCH ₃	H	C=O	PhCH ₂
S-203	0	OCH ₃	H	C=O	Ph (CH ₃) CH
S-204	0	OCH ₃	H	C=O	Ph (CH ₃) 2C
S-205	0	OCH ₃	H	C=O	Ph
S-206	0	OCH ₃	H	C=O	2-C1-Ph
S-207	0	OCH ₃	H	C=O	3-C1-Ph
S-208	0	OCH ₃	H	C=O	4-C1-Ph
S-209	0	OCH ₃	H	C=O	4-CF ₃ O-Ph
S-210	0	OCH ₃	H	C=O	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-211	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	CH ₃
S-212	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	C ₂ H ₅
S-213	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	正-C ₃ H ₇
S-214	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	异-C ₃ H ₇
S-215	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	正-C ₄ H ₉
S-216	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	异-C ₄ H ₉
S-217	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	仲-C ₄ H ₉
S-218	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	叔-C ₄ H ₉
S-219	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	正-C ₅ H ₁₁
S-220	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	正-C ₆ H ₁₃
S-221	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	环-C ₃ H ₅
S-222	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	环-C ₅ H ₉
S-223	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	环-C ₆ H ₁₁
S-224	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	CH ₂ =CHCH ₂
S-225	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	CHCCH ₂
S-226	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	PhCH ₂
S-227	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	Ph (CH ₃) CH
S-228	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	Ph (CH ₃) 2C
S-229	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	Ph
S-230	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	2-C1-Ph
S-231	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	3-C1-Ph
S-232	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	4-C1-Ph
S-233	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	4-CF ₃ O-Ph
S-234	0	OCH ₂ CH ₃	H	C=O	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-235	0	H	H	CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
S-236	0	H	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-237	0	H	H	CH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
S-238	0	H	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-239	0	H	H	CH ₂ CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-240	0	H	H	CH ₂ CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-241	0	H	H	CH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉

化合物	U	R ⁷	R ⁸	W	R ⁴
S-242	0	H	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-243	0	H	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-244	0	H	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-245	0	H	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₅ H ₉
S-246	0	H	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₆ H ₁₁
S-247	0	H	H	CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-248	0	H	H	CH ₂ CH ₂	CHCCH ₂
S-249	0	H	H	CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
S-250	0	H	H	CH ₂ CH ₂	Ph (CH ₃) CH
S-251	0	H	H	CH ₂ CH ₂	Ph (CH ₃) 2C
S-252	0	H	H	CH ₂ CH ₂	Ph
S-253	0	H	H	CH ₂ CH ₂	2-C ₁ -Ph
S-254	0	H	H	CH ₂ CH ₂	3-C ₁ -Ph
S-255	0	H	H	CH ₂ CH ₂	4-C ₁ -Ph
S-256	0	H	H	CH ₂ CH ₂	4-CF ₃ O-Ph
S-257	0	H	H	CH ₂ CH ₂	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-258	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	CH ₃
S-259	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
S-260	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-261	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
S-262	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-263	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-264	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-265	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
S-266	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-267	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-268	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-269	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₅ H ₉
S-270	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₆ H ₁₁
S-271	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-272	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	CHCCH ₂
S-273	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
S-274	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	Ph (CH ₃) CH
S-275	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	Ph (CH ₃) 2C
S-276	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	Ph
S-277	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	2-C ₁ -Ph
S-278	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	3-C ₁ -Ph
S-279	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	4-C ₁ -Ph
S-280	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	4-CF ₃ O-Ph
S-281	0	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-282	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	H
S-283	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	CH ₃

化合物	U	R ⁷	R ⁸	W	R ⁴
S-284	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
S-285	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-286	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
S-287	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-288	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-289	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-290	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
S-291	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-292	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-293	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-294	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	环-C ₅ H ₉
S-295	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	环-C ₆ H ₁₁
S-296	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-297	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	CHCCH ₂
S-298	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
S-299	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	Ph (CH ₃) CH
S-300	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	Ph (CH ₃) 2C
S-301	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	Ph
S-302	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	2-C ₁ -Ph
S-303	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	3-C ₁ -Ph
S-304	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	4-C ₁ -Ph
S-305	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	4-CF ₃ -Ph
S-306	0	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	4-(4-CF ₃ -Ph)-Ph
S-307	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	CH ₃
S-308	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
S-309	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-310	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
S-311	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-312	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-313	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-314	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
S-315	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-316	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-317	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-318	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₅ H ₉
S-319	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₆ H ₁₁
S-320	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-321	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	CHCCH ₂
S-322	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
S-323	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	Ph (CH ₃) CH
S-324	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	Ph (CH ₃) 2C
S-325	0	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	Ph

化合物	U	R ⁷	R ⁸	W	R ⁴
S-326	O	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	2-C1-Ph
S-327	O	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	3-C1-Ph
S-328	O	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	4-C1-Ph
S-329	O	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	4-CF ₃ O-Ph
S-330	O	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-331	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	H
S-332	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	CH ₃
S-333	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
S-334	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-335	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
S-336	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-337	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-338	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-339	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
S-340	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-341	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-342	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-343	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₅ H ₉
S-344	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₆ H ₁₁
S-345	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-346	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	CHCCH ₂
S-347	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
S-348	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	Ph(CH ₃)CH
S-349	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	Ph(CH ₃) ₂ C
S-350	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	Ph
S-351	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	2-C1-Ph
S-352	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	3-C1-Ph
S-353	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	4-C1-Ph
S-354	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	4-CF ₃ O-Ph
S-355	O	OCH ₂ CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-356	S	H	H	CH ₂	H
S-357	S	H	H	CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-358	S	H	H	CH ₂	异-C ₃ H ₇
S-359	S	H	H	CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-360	S	H	H	CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-361	S	H	H	CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-362	S	H	H	CH ₂	叔-C ₄ H ₉
S-363	S	H	H	CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-364	S	H	H	CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-365	S	H	H	CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-366	S	H	H	CH ₂	环-C ₅ H ₉
S-367	S	H	H	CH ₂	环-C ₆ H ₁₁

化合物	U	R ⁷	R ⁸	W	R ⁴
S-368	S	H	H	CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-369	S	H	H	CH ₂	CHCCH ₂
S-370	S	H	H	CH ₂	PhCH ₂
S-371	S	H	H	CH ₂	Ph (CH ₃) CH
S-372	S	H	H	CH ₂	Ph (CH ₃) 2C
S-373	S	H	H	CH ₂	Ph
S-374	S	H	H	CH ₂	2-C1-Ph
S-375	S	H	H	CH ₂	3-C1-Ph
S-376	S	H	H	CH ₂	4-C1-Ph
S-377	S	H	H	CH ₂	4-CF ₃ O-Ph
S-378	S	H	H	CH ₂	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-379	S	CH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅
S-380	S	CH ₃	H	CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-381	S	CH ₃	H	CH ₂	异-C ₃ H ₇
S-382	S	CH ₃	H	CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-383	S	CH ₃	H	CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-384	S	CH ₃	H	CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-385	S	CH ₃	H	CH ₂	叔-C ₄ H ₉
S-386	S	CH ₃	H	CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-387	S	CH ₃	H	CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-388	S	CH ₃	H	CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-389	S	CH ₃	H	CH ₂	环-C ₅ H ₉
S-390	S	CH ₃	H	CH ₂	环-C ₆ H ₁₁
S-391	S	CH ₃	H	CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-392	S	CH ₃	H	CH ₂	CHCCH ₂
S-393	S	CH ₃	H	CH ₂	PhCH ₂
S-394	S	CH ₃	H	CH ₂	Ph (CH ₃) CH
S-395	S	CH ₃	H	CH ₂	Ph (CH ₃) 2C
S-396	S	CH ₃	H	CH ₂	Ph
S-397	S	CH ₃	H	CH ₂	2-C1-Ph
S-398	S	CH ₃	H	CH ₂	3-C1-Ph
S-399	S	CH ₃	H	CH ₂	4-C1-Ph
S-400	S	CH ₃	H	CH ₂	4-CF ₃ O-Ph
S-401	S	CH ₃	H	CH ₂	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-402	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	CH ₃
S-403	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	C ₂ H ₅
S-404	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-405	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	异-C ₃ H ₇
S-406	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-407	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-408	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-409	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	叔-C ₄ H ₉

化合物	U	R ⁷	R ⁸	W	R ⁴
S-410	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-411	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-412	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-413	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	环-C ₅ H ₉
S-414	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	环-C ₆ H ₁₁
S-415	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-416	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	CHCCH ₂
S-417	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	PhCH ₂
S-418	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	Ph(CH ₃)CH
S-419	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	Ph(CH ₃) ₂ C
S-420	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	Ph
S-421	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	2-C ₁ -Ph
S-422	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	3-C ₁ -Ph
S-423	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	4-C ₁ -Ph
S-424	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	4-CF ₃ -Ph
S-425	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-426	S	OCH ₃	H	CH ₂	C ₂ H ₅
S-427	S	OCH ₃	H	CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-428	S	OCH ₃	H	CH ₂	异-C ₃ H ₇
S-429	S	OCH ₃	H	CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-430	S	OCH ₃	H	CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-431	S	OCH ₃	H	CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-432	S	OCH ₃	H	CH ₂	叔-C ₄ H ₉
S-433	S	OCH ₃	H	CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-434	S	OCH ₃	H	CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-435	S	OCH ₃	H	CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-436	S	OCH ₃	H	CH ₂	环-C ₅ H ₉
S-437	S	OCH ₃	H	CH ₂	环-C ₆ H ₁₁
S-438	S	OCH ₃	H	CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-439	S	OCH ₃	H	CH ₂	CHCCH ₂
S-440	S	OCH ₃	H	CH ₂	PhCH ₂
S-441	S	OCH ₃	H	CH ₂	Ph(CH ₃)CH
S-442	S	OCH ₃	H	CH ₂	Ph(CH ₃) ₂ C
S-443	S	OCH ₃	H	CH ₂	Ph
S-444	S	OCH ₃	H	CH ₂	2-C ₁ -Ph
S-445	S	OCH ₃	H	CH ₂	3-C ₁ -Ph
S-446	S	OCH ₃	H	CH ₂	4-C ₁ -Ph
S-447	S	OCH ₃	H	CH ₂	4-CF ₃ -Ph
S-448	S	OCH ₃	H	CH ₂	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-449	S	H	H	CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
S-450	S	H	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-451	S	H	H	CH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇

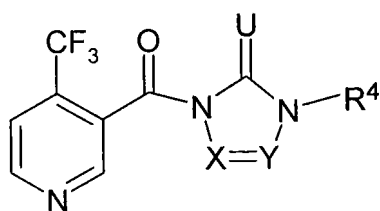
化合物	U	R ⁷	R ⁸	W	R ⁴
S-452	S	H	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-453	S	H	H	CH ₂ CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-454	S	H	H	CH ₂ CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-455	S	H	H	CH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
S-456	S	H	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-457	S	H	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-458	S	H	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-459	S	H	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₅ H ₉
S-460	S	H	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₆ H ₁₁
S-461	S	H	H	CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-462	S	H	H	CH ₂ CH ₂	CHCCH ₂
S-463	S	H	H	CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
S-464	S	H	H	CH ₂ CH ₂	Ph (CH ₃) CH
S-465	S	H	H	CH ₂ CH ₂	Ph (CH ₃) 2C
S-466	S	H	H	CH ₂ CH ₂	Ph
S-467	S	H	H	CH ₂ CH ₂	2-C ₁ -Ph
S-468	S	H	H	CH ₂ CH ₂	3-C ₁ -Ph
S-469	S	H	H	CH ₂ CH ₂	4-C ₁ -Ph
S-470	S	H	H	CH ₂ CH ₂	4-CF ₃ O-Ph
S-471	S	H	H	CH ₂ CH ₂	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-472	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	CH ₃
S-473	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
S-474	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-475	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
S-476	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-477	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-478	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-479	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
S-480	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-481	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-482	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-483	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₅ H ₉
S-484	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₆ H ₁₁
S-485	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-486	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	CHCCH ₂
S-487	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
S-488	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	Ph (CH ₃) CH
S-489	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	Ph (CH ₃) 2C
S-490	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	Ph
S-491	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	2-C ₁ -Ph
S-492	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	3-C ₁ -Ph
S-493	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	4-C ₁ -Ph

化合物	U	R ⁷	R ⁸	W	R ⁴
S-494	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	4-CF ₃ O-Ph
S-495	S	CH ₃	H	CH ₂ CH ₂	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-496	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	H
S-497	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	CH ₃
S-498	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
S-499	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-500	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
S-501	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-502	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-503	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-504	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-505	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-506	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-507	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
S-508	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-509	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-510	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-511	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	环-C ₅ H ₉
S-512	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	环-C ₆ H ₁₁
S-513	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-514	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	CHCCH ₂
S-515	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
S-516	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	Ph(CH ₃)CH
S-517	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	Ph(CH ₃) ₂ C
S-518	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	Ph
S-519	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	2-C ₁ -Ph
S-520	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	3-C ₁ -Ph
S-521	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	4-C ₁ -Ph
S-522	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	4-CF ₃ O-Ph
S-523	S	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-524	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	CH ₃
S-525	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
S-526	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₃ H ₇
S-527	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	异-C ₃ H ₇
S-528	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₄ H ₉
S-529	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	异-C ₄ H ₉
S-530	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	仲-C ₄ H ₉
S-531	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	叔-C ₄ H ₉
S-532	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₅ H ₁₁
S-533	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	正-C ₆ H ₁₃
S-534	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₃ H ₅
S-535	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₅ H ₉

化合物	U	R ⁷	R ⁸	W	R ⁴
S-536	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	环-C ₆ H ₁₁
S-537	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂
S-538	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	CHCCH ₂
S-539	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	PhCH ₂
S-540	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	Ph (CH ₃) CH
S-541	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	Ph (CH ₃) 2C
S-542	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	Ph
S-543	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	2-C1-Ph
S-544	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	3-C1-Ph
S-545	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	4-C1-Ph
S-546	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	4-CF ₃ O-Ph
S-547	S	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
S-548	O	H	H	CH ₂	CH ₃ O
S-549	O	H	H	CH ₂	PhCH ₂ O
S-550	O	H	H	CH (CH ₃)	H
S-551	O	H	H	CH (C ₂ H ₅)	H
S-552	O	H	H	CH (C ₂ H ₅)	PhCH ₂
S-553	O	H	H	CHPh	H
S-554	O	H	H	CHPh	CH ₃
S-555	O	H	H	CHPh	PhCH ₂
S-556	O	CH ₃	H	CH ₂	H
S-557	O	Ph	H	CH ₂	H
S-558	O	Ph	H	CH ₂	CH ₃
S-559	O	Ph	H	CH ₂	PhCH ₂

表 5

式 (1B) 化合物:



(1B)

化合物	U	X	Y	R ⁴
T-1	0	CH	CH	H
T-2	0	CH	CH	正-C ₃ H ₇
T-3	0	CH	CH	异-C ₃ H ₇
T-4	0	CH	CH	正-C ₄ H ₉
T-5	0	CH	CH	异-C ₄ H ₉
T-6	0	CH	CH	仲-C ₄ H ₉
T-7	0	CH	CH	叔-C ₄ H ₉
T-8	0	CH	CH	正-C ₅ H ₁₁
T-9	0	CH	CH	正-C ₆ H ₁₃
T-10	0	CH	CH	环-C ₃ H ₅
T-11	0	CH	CH	环-C ₅ H ₉
T-12	0	CH	CH	环-C ₆ H ₁₁
T-13	0	CH	CH	CH ₂ =CHCH ₂
T-14	0	CH	CH	CH ₂ CCH
T-15	0	CH	CH	PhCH ₂
T-16	0	CH	CH	Ph (CH ₃) CH
T-17	0	CH	CH	Ph
T-18	0	CH	CH	2-C ₁ -Ph
T-19	0	CH	CH	3-C ₁ -Ph
T-20	0	CH	CH	4-C ₁ -Ph
T-21	0	CH	CH	4-CF ₃ O-Ph
T-22	0	CH	CH	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
T-23	0	CH	N	H
T-24	0	CH	N	CH ₃
T-25	0	CH	N	正-C ₄ H ₉
T-26	0	CH	N	异-C ₄ H ₉
T-27	0	CH	N	仲-C ₄ H ₉
T-28	0	CH	N	叔-C ₄ H ₉
T-29	0	CH	N	正-C ₅ H ₁₁
T-30	0	CH	N	正-C ₆ H ₁₃
T-31	0	CH	N	环-C ₃ H ₅

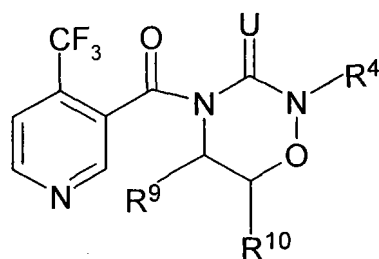
化合物	U	X	Y	R ⁴
T-32	O	CH	N	环-C ₅ H ₉
T-33	O	CH	N	环-C ₆ H ₁₁
T-34	O	CH	N	CH ₂ =CHCH ₂
T-35	O	CH	N	CH ₂ CCH
T-36	O	CH	N	PhCH ₂
T-37	O	CH	N	Ph (CH ₃) CH
T-38	O	CH	N	Ph
T-39	O	CH	N	2-C ₁ -Ph
T-40	O	CH	N	3-C ₁ -Ph
T-41	O	CH	N	4-C ₁ -Ph
T-42	O	CH	N	4-CF ₃ O-Ph
T-43	O	CH	N	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
T-44	O	N	N	H
T-45	O	N	N	CH ₃
T-46	O	N	N	C ₂ H ₅
T-47	O	N	N	正-C ₅ H ₁₁
T-48	O	N	N	正-C ₆ H ₁₃
T-49	O	N	N	环-C ₃ H ₅
T-50	O	N	N	环-C ₅ H ₉
T-51	O	N	N	环-C ₆ H ₁₁
T-52	O	N	N	CH ₂ =CHCH ₂
T-53	O	N	N	CH ₂ CCH
T-54	O	N	N	PhCH ₂
T-55	O	N	N	Ph (CH ₃) CH
T-56	O	N	N	Ph
T-57	O	N	N	2-C ₁ -Ph
T-58	O	N	N	3-C ₁ -Ph
T-59	O	N	N	4-C ₁ -Ph
T-60	O	N	N	4-CF ₃ O-Ph
T-61	O	N	N	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
T-62	S	CH	CH	H
T-63	S	CH	CH	正-C ₃ H ₇
T-64	S	CH	CH	异-C ₃ H ₇
T-65	S	CH	CH	正-C ₄ H ₉
T-66	S	CH	CH	异-C ₄ H ₉
T-67	S	CH	CH	仲-C ₄ H ₉
T-68	S	CH	CH	叔-C ₄ H ₉
T-69	S	CH	CH	正-C ₅ H ₁₁
T-70	S	CH	CH	正-C ₆ H ₁₃
T-71	S	CH	CH	环-C ₃ H ₅
T-72	S	CH	CH	环-C ₅ H ₉
T-73	S	CH	CH	环-C ₆ H ₁₁

化合物	U	X	Y	R ⁴
T-74	S	CH	CH	CH ₂ =CHCH ₂
T-75	S	CH	CH	CH ₂ CCH
T-76	S	CH	CH	PhCH ₂
T-77	S	CH	CH	Ph (CH ₃) CH
T-78	S	CH	CH	Ph
T-79	S	CH	CH	2-C1-Ph
T-80	S	CH	CH	3-C1-Ph
T-81	S	CH	CH	4-C1-Ph
T-82	S	CH	CH	4-CF ₃ O-Ph
T-83	S	CH	CH	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
T-84	S	CH	N	H
T-85	S	CH	N	CH ₃
T-86	S	CH	N	正-C ₄ H ₉
T-87	S	CH	N	异-C ₄ H ₉
T-88	S	CH	N	仲-C ₄ H ₉
T-89	S	CH	N	叔-C ₄ H ₉
T-90	S	CH	N	正-C ₅ H ₁₁
T-91	S	CH	N	正-C ₆ H ₁₃
T-92	S	CH	N	环-C ₃ H ₅
T-93	S	CH	N	环-C ₅ H ₉
T-94	S	CH	N	环-C ₆ H ₁₁
T-95	S	CH	N	CH ₂ =CHCH ₂
T-96	S	CH	N	CH ₂ CCH
T-97	S	CH	N	PhCH ₂
T-98	S	CH	N	Ph (CH ₃) CH
T-99	S	CH	N	Ph
T-100	S	CH	N	2-C1-Ph
T-101	S	CH	N	3-C1-Ph
T-102	S	CH	N	4-C1-Ph
T-103	S	CH	N	4-CF ₃ O-Ph
T-104	S	CH	N	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
T-105	S	N	N	H
T-106	S	N	N	CH ₃
T-107	S	N	N	C ₂ H ₅
T-108	S	N	N	正-C ₅ H ₁₁
T-109	S	N	N	正-C ₆ H ₁₃
T-110	S	N	N	环-C ₃ H ₅
T-111	S	N	N	环-C ₅ H ₉
T-112	S	N	N	环-C ₆ H ₁₁
T-113	S	N	N	CH ₂ =CHCH ₂
T-114	S	N	N	CH ₂ CCH
T-115	S	N	N	PhCH ₂

化合物	U	X	Y	R ⁴
T-116	S	N	N	Ph (CH ₃) CH
T-117	S	N	N	Ph
T-118	S	N	N	2-C1-Ph
T-119	S	N	N	3-C1-Ph
T-120	S	N	N	4-C1-Ph
T-121	S	N	N	4-CF ₃ -Ph
T-122	S	N	N	4-(4-CF ₃ -PhO)-Ph
T-123	S	N	N	Ph

表 6

式 (IC) 化合物:



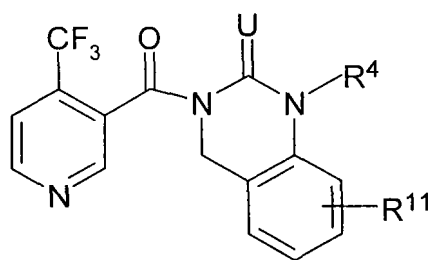
(1C)

化合物	U	R ⁴	R ⁹	R ¹⁰
U-1	0	H	H	H
U-2	0	正-C ₃ H ₇	H	H
U-3	0	异-C ₃ H ₇	H	H
U-4	0	正-C ₄ H ₉	H	H
U-5	0	异-C ₄ H ₉	H	H
U-6	0	仲-C ₄ H ₉	H	H
U-7	0	叔-C ₄ H ₉	H	H
U-8	0	正-C ₅ H ₁₁	H	H
U-9	0	正-C ₆ H ₁₃	H	H
U-10	0	环-C ₃ H ₅	H	H
U-11	0	环-C ₅ H ₉	H	H
U-12	0	环-C ₆ H ₁₁	H	H
U-13	0	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
U-14	0	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H	H
U-15	0	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H	H
U-16	0	CH ₂ CH=CHCH ₃	H	H
U-17	0	CH ₂ CCCH ₃	H	H
U-18	0	CH ₂ CCCH ₃	H	H
U-19	0	CH(CH ₃)CCH ₃	H	H

化合物	U	R ⁴	R ⁹	R ¹⁰
U-20	O	PhCH ₂	H	H
U-21	O	Ph (CH ₃) CH	H	H
U-22	O	Ph (CH ₃) ₂ C	H	H
U-23	O	Ph	H	H
U-24	O	2-C ₁ -Ph	H	H
U-25	O	3-C ₁ -Ph	H	H
U-26	O	4-C ₁ -Ph	H	H
U-27	S	H	H	H
U-28	S	正-C ₃ H ₇	H	H
U-29	S	异-C ₃ H ₇	H	H
U-30	S	正-C ₄ H ₉	H	H
U-31	S	异-C ₄ H ₉	H	H
U-32	S	仲-C ₄ H ₉	H	H
U-33	S	叔-C ₄ H ₉	H	H
U-34	S	正-C ₅ H ₁₁	H	H
U-35	S	正-C ₆ H ₁₃	H	H
U-36	S	环-C ₃ H ₅	H	H
U-37	S	环-C ₅ H ₉	H	H
U-38	S	环-C ₆ H ₁₁	H	H
U-39	S	CH ₂ CH=CH ₂	H	H
U-40	S	CH ₂ C (CH ₃) =CH ₂	H	H
U-41	S	CH (CH ₃) CH=CH ₂	H	H
U-42	S	CH ₂ CH=CHCH ₃	H	H
U-43	S	CH ₂ CCH	H	H
U-44	S	CH ₂ CCCH ₃	H	H
U-45	S	CH (CH ₃) CCH	H	H
U-46	S	PhCH ₂	H	H
U-47	S	Ph (CH ₃) CH	H	H
U-48	S	Ph (CH ₃) ₂ C	H	H
U-49	S	Ph	H	H
U-50	S	2-C ₁ -Ph	H	H
U-51	S	3-C ₁ -Ph	H	H
U-52	S	4-C ₁ -Ph	H	H

表 7

式 (ID) 化合物:



(1D)

化合物	U	R ⁴	R ¹¹
V-1	0	H	H
V-2	0	CH ₃	H
V-3	0	C ₂ H ₅	H
V-4	0	正-C ₃ H ₇	H
V-5	0	异-C ₃ H ₇	H
V-6	0	正-C ₄ H ₉	H
V-7	0	异-C ₄ H ₉	H
V-8	0	仲-C ₄ H ₉	H
V-9	0	叔-C ₄ H ₉	H
V-10	0	正-C ₅ H ₁₁	H
V-11	0	正-C ₆ H ₁₃	H
V-12	0	环-C ₃ H ₅	H
V-13	0	环-C ₅ H ₉	H
V-14	0	环-C ₆ H ₁₁	H
V-15	0	CH ₂ CH=CH ₂	H
V-16	0	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
V-17	0	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H
V-18	0	CH ₂ CH=CHCH ₃	H
V-19	0	CH ₂ CCH ₃	H
V-20	0	CH ₂ CCCH ₃	H
V-21	0	CH(CH ₃)CCH ₃	H
V-22	0	PhCH ₂	H
V-23	0	Ph(CH ₃)CH	H
V-24	0	Ph(CH ₃) ₂ C	H
V-25	0	Ph	H
V-26	0	2-C ₁ -Ph	H
V-27	0	3-C ₁ -Ph	H
V-28	0	4-C ₁ -Ph	H
V-29	S	H	H
V-30	S	CH ₃	H
V-31	S	C ₂ H ₅	H
V-32	S	正-C ₃ H ₇	H
V-33	S	异-C ₃ H ₇	H

化合物	U	R ⁴	R ¹¹
V-34	S	正-C ₄ H ₉	H
V-35	S	异-C ₄ H ₉	H
V-36	S	仲-C ₄ H ₉	H
V-37	S	叔-C ₄ H ₉	H
V-38	S	正-C ₅ H ₁₁	H
V-39	S	正-C ₆ H ₁₃	H
V-40	S	环-C ₃ H ₅	H
V-41	S	环-C ₅ H ₉	H
V-42	S	环-C ₆ H ₁₁	H
V-43	S	CH ₂ CH=CH ₂	H
V-44	S	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	H
V-45	S	CH(CH ₃)CH=CH ₂	H
V-46	S	CH ₂ CH=CHCH ₃	H
V-47	S	CH ₂ CCH	H
V-48	S	CH ₂ CCCH ₃	H
V-49	S	CH(CH ₃)CCH	H
V-50	S	PhCH ₂	H
V-51	S	Ph(CH ₃)CH	H
V-52	S	Ph(CH ₃) ₂ C	H
V-53	S	Ph	H
V-54	S	2-C ₁ -Ph	H
V-55	S	3-C ₁ -Ph	H
V-56	S	4-C ₁ -Ph	H

表 8

式 (I) 化合物, 其中 R¹ 为 -C(=U)NR³R⁴, U 为 NR¹⁸ 并且 m 为 0。

化合物	R ³	R ⁴	R ²	R ¹⁸
W-1	CH ₃	H	H	H
W-2	C ₂ H ₅	H	H	H
W-3	正-C ₃ H ₇	H	H	H
W-4	异-C ₃ H ₇	H	H	H
W-5	正-C ₄ H ₉	H	H	H
W-6	异-C ₄ H ₉	H	H	H
W-7	叔-C ₄ H ₉	H	H	H
W-8	正-C ₅ H ₁₁	H	H	H
W-9	(CH ₃) ₃ CCCH ₂	H	H	H
W-10	正-C ₆ H ₁₃	H	H	H
W-11	CH ₂ =CHCH ₂	H	H	H
W-12	CHCCH ₂	H	H	H

化合物	R ³	R ⁴	R ²	R ¹⁸
W-13	环-C ₃ H ₅	H	H	H
W-14	环-C ₅ H ₉	H	H	H
W-15	环-C ₆ H ₁₁	H	H	H
W-16	PhCH ₂	H	H	H
W-17	PhCH (CH ₃)	H	H	H
W-18	CH ₃ NH	H	H	H
W-19	C ₂ H ₅ NH	H	H	H
W-20	正-C ₃ H ₇ NH	H	H	H
W-21	异-C ₃ H ₇ NH	H	H	H
W-22	正-C ₄ H ₉ NH	H	H	H
W-23	叔-C ₄ H ₉ NH	H	H	H
W-24	正-C ₅ H ₁₁ NH	H	H	H
W-25	正-C ₆ H ₁₃ NH	H	H	H
W-26	PhCH ₂ NH	H	H	H
W-27	PhNH	H	H	H
W-28	Ph	H	H	H
W-29	2-F-Ph	H	H	H
W-30	3-F-Ph	H	H	H
W-31	4-F-Ph	H	H	H
W-32	2-C ₁ -Ph	H	H	H
W-33	3-C ₁ -Ph	H	H	H
W-34	4-C ₁ -Ph	H	H	H
W-35	2-CF ₃ -Ph	H	H	H
W-36	3-CF ₃ -Ph	H	H	H
W-37	4-CF ₃ -Ph	H	H	H
W-38	2-CH ₃ -Ph	H	H	H
W-39	3-CH ₃ -Ph	H	H	H
W-40	4-CH ₃ -Ph	H	H	H
W-41	2-CH ₃ O-Ph	H	H	H
W-42	3-CH ₃ O-Ph	H	H	H
W-43	4-CH ₃ O-Ph	H	H	H
W-44	CF ₃ CH ₂	H	H	H
W-45	C ₁ CH ₂ CH ₂	H	H	H
W-46	C ₁ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	H
W-47	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	H	H	H
W-48	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	H	H	H
W-49	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	H
W-50	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	H
W-51	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	H
W-52	CH ₃ OCH (CH ₃) CH ₂ CH ₂	H	H	H
W-53	(CH ₃ O) ₂ CHCH ₂	H	H	H
W-54	HOCH ₂ CH ₂	H	H	H
W-55	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	H

化合物	R ³	R ⁴	R ²	R ¹⁸
W-56	CH ₃ SCH ₂ CH ₂	H	H	H
W-57	CH ₃ CH ₂ SCH ₂ CH ₂	H	H	H
W-58	CH ₃ SCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	H
W-59	C ₂ H ₅ SCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	H
W-60	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		H	H
W-61	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		H	H
W-62	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂		H	H
W-63	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂		H	H
W-64	CH ₂ CH ₂ NHCH ₂ CH ₂		H	H
W-65	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂		H	H
W-66	N=CHCH ₂ CH ₂		H	H
W-67	N=CHCH=CH		H	H
W-68	CH ₃	CH ₃	H	H
W-69	C ₂ H ₅	CH ₃	H	H
W-70	正-C ₃ H ₇	CH ₃	H	H
W-71	异-C ₃ H ₇	CH ₃	H	H
W-72	正-C ₄ H ₉	CH ₃	H	H
W-73	异-C ₄ H ₉	CH ₃	H	H
W-74	叔-C ₄ H ₉	CH ₃	H	H
W-75	正-C ₅ H ₁₁	CH ₃	H	H
W-76	正-C ₆ H ₁₃	CH ₃	H	H
W-77	CH ₂ =CHCH ₂	CH ₃	H	H
W-78	CHCCH ₂	CH ₃	H	H
W-79	环-C ₃ H ₅	CH ₃	H	H
W-80	环-C ₅ H ₉	CH ₃	H	H
W-81	环-C ₆ H ₁₁	CH ₃	H	H
W-82	PhCH ₂	CH ₃	H	H
W-83	CH ₃ NH	CH ₃	H	H
W-84	C ₂ H ₅ NH	CH ₃	H	H
W-85	正-C ₃ H ₇ NH	CH ₃	H	H
W-86	异-C ₃ H ₇ NH	CH ₃	H	H
W-87	正-C ₄ H ₉ NH	CH ₃	H	H
W-88	叔-C ₄ H ₉ NH	CH ₃	H	H
W-89	正-C ₅ H ₁₁ NH	CH ₃	H	H
W-90	正-C ₆ H ₁₃ NH	CH ₃	H	H
W-91	PhCH ₂ NH	CH ₃	H	H
W-92	PhNH	CH ₃	H	H
W-93	Ph	CH ₃	H	H
W-94	2-F-Ph	CH ₃	H	H
W-95	3-F-Ph	CH ₃	H	H
W-96	4-F-Ph	CH ₃	H	H
W-97	2-C1-Ph	CH ₃	H	H
W-98	3-C1-Ph	CH ₃	H	H

化合物	R ³	R ⁴	R ²	R ¹⁸
W-99	4-C1-Ph	CH3	H	H
W-100	2-CF3-Ph	CH3	H	H
W-101	3-CF3-Ph	CH3	H	H
W-102	4-CF3-Ph	CH3	H	H
W-103	2-CH3-Ph	CH3	H	H
W-104	3-CH3-Ph	CH3	H	H
W-105	4-CH3-Ph	CH3	H	H
W-106	2-CH3O-Ph	CH3	H	H
W-107	3-CH3O-Ph	CH3	H	H
W-108	4-CH3O-Ph	CH3	H	H
W-109	CF3CH2	CH3	H	H
W-110	C1CH2CH2	CH3	H	H
W-111	C1CH2CH2CH2	CH3	H	H
W-112	CH3OCH2CH2	CH3	H	H
W-113	CH3CH2OCH2CH2	CH3	H	H
W-114	CH3OCH2CH2CH2	CH3	H	H
W-115	C2H5OCH2CH2CH2	CH3	H	H
W-116	正-C4H9OCH2CH2CH2	CH3	H	H
W-117	CH3OCH(CH3)CH2CH2	CH3	H	H
W-118	(CH3O)2CHCH2	CH3	H	H
W-119	HOCH2CH2	CH3	H	H
W-120	HOCH2CH2CH2	CH3	H	H
W-121	CH3	C2H5	H	H
W-122	C2H5	C2H5	H	H
W-123	正-C3H7	C2H5	H	H
W-124	异-C3H7	C2H5	H	H
W-125	CH2=CHCH2	C2H5	H	H
W-126	CHCCH2	C2H5	H	H
W-127	环-C3H5	C2H5	H	H
W-128	PhCH2	C2H5	H	H
W-129	CH3NH	C2H5	H	H
W-130	C2H5NH	C2H5	H	H
W-131	PhCH2NH	C2H5	H	H
W-132	PhNH	C2H5	H	H
W-133	Ph	C2H5	H	H
W-134	2-C1-Ph	C2H5	H	H
W-135	3-C1-Ph	C2H5	H	H
W-136	4-C1-Ph	C2H5	H	H
W-137	2-CF3-Ph	C2H5	H	H
W-138	3-CF3-Ph	C2H5	H	H
W-139	4-CF3-Ph	C2H5	H	H
W-140	2-CH3O-Ph	C2H5	H	H
W-141	3-CH3O-Ph	C2H5	H	H

化合物	R ³	R ⁴	R ²	R ¹⁸
W-142	4-CH ₃ O-Ph	C ₂ H ₅	H	H
W-143	CF ₃ CH ₂	C ₂ H ₅	H	H
W-144	C ₁ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅	H	H
W-145	C ₁ CH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅	H	H
W-146	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅	H	H
W-147	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅	H	H
W-148	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅	H	H
W-149	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅	H	H
W-150	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅	H	H
W-151	CH ₃ OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅	H	H
W-152	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	C ₂ H ₅	H	H
W-153	HOCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅	H	H
W-154	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅	H	H
W-155	CH ₃	H	H	CH ₃
W-156	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃
W-157	正-C ₃ H ₇	H	H	CH ₃
W-158	异-C ₃ H ₇	H	H	CH ₃
W-159	叔-C ₄ H ₉	H	H	CH ₃
W-160	CH ₂ =CHCH ₂	H	H	CH ₃
W-161	CHCCH ₂	H	H	CH ₃
W-162	环-C ₃ H ₅	H	H	CH ₃
W-163	PhCH ₂	H	H	CH ₃
W-164	CH ₃ NH	H	H	CH ₃
W-165	C ₂ H ₅ NH	H	H	CH ₃
W-166	正-C ₃ H ₇ NH	H	H	CH ₃
W-167	异-C ₃ H ₇ NH	H	H	CH ₃
W-168	PhCH ₂ NH	H	H	CH ₃
W-169	PhNH	H	H	CH ₃
W-170	Ph	H	H	CH ₃
W-171	2-C ₁ -Ph	H	H	CH ₃
W-172	3-C ₁ -Ph	H	H	CH ₃
W-173	4-C ₁ -Ph	H	H	CH ₃
W-174	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	H	H	CH ₃
W-175	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	H	H	CH ₃
W-176	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₃
W-177	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₃
W-178	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₃
W-179	CH ₃ OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₃
W-180	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	H	H	CH ₃
W-181	HOCH ₂ CH ₂	H	H	CH ₃
W-182	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	CH ₃
W-183	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		H	CH ₃
W-184	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		H	CH ₃

化合物	R ³	R ⁴	R ²	R ¹⁸
W-185	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂		H	CH ₃
W-186	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂		H	CH ₃
W-187	CH ₂ CH ₂ NHCH ₂ CH ₂		H	CH ₃
W-188	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂		H	CH ₃
W-189	N=CHCH ₂ CH ₂		H	CH ₃
W-190	CH ₃	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-191	C ₂ H ₅	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-192	正-C ₃ H ₇	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-193	异-C ₃ H ₇	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-194	叔-C ₄ H ₉	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-195	CH ₂ =CHCH ₂	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-196	CHCCH ₂	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-197	环-C ₃ H ₅	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-198	PhCH ₂	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-199	CH ₃ NH	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-200	PhCH ₂ NH	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-201	PhNH	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-202	Ph	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-203	2-C ₁ -Ph	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-204	3-C ₁ -Ph	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-205	4-C ₁ -Ph	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-206	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-207	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-208	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-209	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-210	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-211	HOCH ₂ CH ₂	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-212	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	叔-C ₄ H ₉
W-213	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		H	叔-C ₄ H ₉
W-214	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		H	叔-C ₄ H ₉
W-215	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂		H	叔-C ₄ H ₉
W-216	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂		H	叔-C ₄ H ₉
W-217	CH ₂ CH ₂ NHCH ₂ CH ₂		H	叔-C ₄ H ₉
W-218	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂		H	叔-C ₄ H ₉
W-219	N=CHCH ₂ CH ₂		H	叔-C ₄ H ₉
W-220	CH ₃	H	H	OH
W-221	C ₂ H ₅	H	H	OH
W-222	正-C ₃ H ₇	H	H	OH
W-223	异-C ₃ H ₇	H	H	OH
W-224	叔-C ₄ H ₉	H	H	OH
W-225	CH ₂ =CHCH ₂	H	H	OH
W-226	CHCCH ₂	H	H	OH
W-227	环-C ₃ H ₅	H	H	OH

化合物	R ³	R ⁴	R ²	R ¹⁸
W-228	PhCH ₂	H	H	OH
W-229	CH ₃ NH	H	H	OH
W-230	C ₂ H ₅ NH	H	H	OH
W-231	PhCH ₂ NH	H	H	OH
W-232	PhNH	H	H	OH
W-233	Ph	H	H	OH
W-234	2-C ₁ -Ph	H	H	OH
W-235	3-C ₁ -Ph	H	H	OH
W-236	4-C ₁ -Ph	H	H	OH
W-237	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	H	H	OH
W-238	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	H	H	OH
W-239	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	OH
W-240	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	OH
W-241	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	OH
W-242	CH ₃ OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₂	H	H	OH
W-243	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	H	H	OH
W-244	HOCH ₂ CH ₂	H	H	OH
W-245	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	H	H	OH
W-246	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		H	OH
W-247	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂		H	OH
W-248	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂		H	OH
W-249	CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂		H	OH
W-250	CH ₂ CH ₂ NHCH ₂ CH ₂		H	OH
W-251	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂		H	OH
W-252	N=CHCH ₂ CH ₂		H	OH
W-253	N=CHCH=CH		H	OH
W-254	CH ₃	H	H	CH ₃ O
W-255	C ₂ H ₅	H	H	CH ₃ O
W-256	正-C ₃ H ₇	H	H	CH ₃ O
W-257	异-C ₃ H ₇	H	H	CH ₃ O
W-258	叔-C ₄ H ₉	H	H	CH ₃ O
W-259	CH ₂ =CHCH ₂	H	H	CH ₃ O
W-260	CHCCH ₂	H	H	CH ₃ O
W-261	环-C ₃ H ₅	H	H	CH ₃ O
W-262	PhCH ₂	H	H	CH ₃ O
W-263	CH ₃ NH	H	H	CH ₃ O
W-264	C ₂ H ₅ NH	H	H	CH ₃ O
W-265	PhCH ₂ NH	H	H	CH ₃ O
W-266	PhNH	H	H	CH ₃ O
W-267	Ph	H	H	CH ₃ O
W-268	2-C ₁ -Ph	H	H	CH ₃ O
W-269	3-C ₁ -Ph	H	H	CH ₃ O
W-270	4-C ₁ -Ph	H	H	CH ₃ O

化合物	R ³	R ⁴	R ²	R ¹⁸
W-271	CH3OCH2CH2	H	H	CH3O
W-272	CH3CH2OCH2CH2	H	H	CH3O
W-273	CH3OCH2CH2CH2	H	H	CH3O
W-274	C2H5OCH2CH2CH2	H	H	CH3O
W-275	正-C4H9OCH2CH2CH2	H	H	CH3O
W-276	CH3OCH(CH3)CH2CH2	H	H	CH3O
W-277	(CH3O)2CHCH2	H	H	CH3O
W-278	HOCH2CH2	H	H	CH3O
W-279	HOCH2CH2CH2	H	H	CH3O
W-280	CH3SCH2CH2	H	H	CH3O
W-281	CH3CH2SCH2CH2	H	H	CH3O
W-282	CH3SCH2CH2CH2	H	H	CH3O
W-283	C2H5SCH2CH2CH2	H	H	CH3O

表 9

式 (I) 化合物, 其中 R¹ 为 -C(=V)OR^{3a} 并且 m 为 0。

化合物	V	R ^{3a}	R ²
X-1	O	环-C3H5	H
X-2	O	环-C5H9	H
X-3	O	环-C6H11	H
X-4	O	CH3NH	H
X-5	O	C2H5NH	H
X-6	O	正-C3H7NH	H
X-7	O	异-C3H7NH	H
X-8	O	正-C4H9NH	H
X-9	O	叔-C4H9NH	H
X-10	O	正-C5H11NH	H
X-11	O	正-C6H13NH	H
X-12	O	PhCH2NH	H
X-13	O	PhNH	H
X-14	O	CF3CH2	H
X-15	O	C1CH2CH2	H
X-16	O	C1CH2CH2CH2	H
X-17	O	CH3OCH2CH2	H
X-18	O	CH3CH2OCH2CH2	H
X-19	O	CH3OCH2CH2CH2	H
X-20	O	C2H5OCH2CH2CH2	H
X-21	O	正-C4H9OCH2CH2CH2	H
X-22	O	CH3OCH(CH3)CH2CH2	H

化合物	V	R ^{3a}	R ²
X-23	0	(CH ₃ O) 2CHCH ₂	H
X-24	0	HOCH ₂ CH ₂	H
X-25	0	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
X-26	0	CH ₃ SCH ₂ CH ₂	H
X-27	0	CH ₃ CH ₂ SCH ₂ CH ₂	H
X-28	0	CH ₃ SCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
X-29	0	C ₂ H ₅ SCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
X-30	0	CH ₃ (环-C ₃ H ₅) CH	H
X-31	0	NCCH ₂ CH ₂	H
X-32	S	环-C ₃ H ₅	H
X-33	S	环-C ₅ H ₉	H
X-34	S	环-C ₆ H ₁₁	H
X-35	S	CH ₃ NH	H
X-36	S	C ₂ H ₅ NH	H
X-37	S	正-C ₃ H ₇ NH	H
X-38	S	异-C ₃ H ₇ NH	H
X-39	S	正-C ₄ H ₉ NH	H
X-40	S	叔-C ₄ H ₉ NH	H
X-41	S	正-C ₅ H ₁₁ NH	H
X-42	S	正-C ₆ H ₁₃ NH	H
X-43	S	PhCH ₂ NH	H
X-44	S	PhNH	H
X-45	S	CF ₃ CH ₂	H
X-46	S	C ₁ CH ₂ CH ₂	H
X-47	S	C ₁ CH ₂ CH ₂ CH ₂	H
X-48	S	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	H
X-49	S	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	H
X-50	S	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
X-51	S	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
X-52	S	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
X-53	S	CH ₃ OCH (CH ₃) CH ₂ CH ₂	H
X-54	S	(CH ₃ O) 2CHCH ₂	H
X-55	S	HOCH ₂ CH ₂	H
X-56	S	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
X-57	S	CH ₃ SCH ₂ CH ₂	H
X-58	S	CH ₃ CH ₂ SCH ₂ CH ₂	H
X-59	S	CH ₃ SCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
X-60	S	C ₂ H ₅ SCH ₂ CH ₂ CH ₂	H
X-61	S	CH ₃ (环-C ₃ H ₅) CH	H
X-62	S	NCCH ₂ CH ₂	H
X-63	0	环-C ₃ H ₅	CH ₃
X-64	0	环-C ₅ H ₉	CH ₃

化合物	V	R ^{3a}	R ²
X-65	0	环-C ₆ H ₁₁	CH ₃
X-66	0	CH ₃ NH	CH ₃
X-67	0	C ₂ H ₅ NH	CH ₃
X-68	0	正-C ₃ H ₇ NH	CH ₃
X-69	0	异-C ₃ H ₇ NH	CH ₃
X-70	0	正-C ₄ H ₉ NH	CH ₃
X-71	0	叔-C ₄ H ₉ NH	CH ₃
X-72	0	正-C ₅ H ₁₁ NH	CH ₃
X-73	0	正-C ₆ H ₁₃ NH	CH ₃
X-74	0	PhCH ₂ NH	CH ₃
X-75	0	PhNH	CH ₃
X-76	0	CF ₃ CH ₂	CH ₃
X-77	0	C ₁ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-78	0	C ₁ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-79	0	CH ₃ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-80	0	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-81	0	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-82	0	C ₂ H ₅ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-83	0	正-C ₄ H ₉ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-84	0	CH ₃ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-85	0	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	CH ₃
X-86	0	HOCH ₂ CH ₂	CH ₃
X-87	0	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-88	0	CH ₃ SCH ₂ CH ₂	CH ₃
X-89	0	CH ₃ CH ₂ SCH ₂ CH ₂	CH ₃
X-90	0	CH ₃ SCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-91	0	C ₂ H ₅ SCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-92	0	CH ₃ (环-C ₃ H ₅)CH	CH ₃
X-93	0	NCCH ₂ CH ₂	CH ₃
X-94	S	环-C ₃ H ₅	CH ₃
X-95	S	环-C ₅ H ₉	CH ₃
X-96	S	环-C ₆ H ₁₁	CH ₃
X-97	S	CH ₃ NH	CH ₃
X-98	S	C ₂ H ₅ NH	CH ₃
X-99	S	正-C ₃ H ₇ NH	CH ₃
X-100	S	异-C ₃ H ₇ NH	CH ₃
X-101	S	正-C ₄ H ₉ NH	CH ₃
X-102	S	叔-C ₄ H ₉ NH	CH ₃
X-103	S	正-C ₅ H ₁₁ NH	CH ₃
X-104	S	正-C ₆ H ₁₃ NH	CH ₃
X-105	S	PhCH ₂ NH	CH ₃
X-106	S	PhNH	CH ₃

化合物	V	R ^{3a}	R ²
X-107	S	CF ₃ CH ₂	CH ₃
X-108	S	C ₁ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-109	S	C ₁ CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-110	S	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	CH ₃
X-111	S	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	CH ₃
X-112	S	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-113	S	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-114	S	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-115	S	CH ₃ OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-116	S	(CH ₃ O) ₂ CHCH ₂	CH ₃
X-117	S	HOCH ₂ CH ₂	CH ₃
X-118	S	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-119	S	CH ₃ SCH ₂ CH ₂	CH ₃
X-120	S	CH ₃ CH ₂ SCH ₂ CH ₂	CH ₃
X-121	S	CH ₃ SCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-122	S	C ₂ H ₅ SCH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₃
X-123	S	CH ₃ (环-C ₃ H ₅)CH	CH ₃
X-124	S	NCCH ₂ CH ₂	CH ₃
X-125	O	环-C ₃ H ₅	C ₂ H ₅
X-126	O	CH ₃ NH	C ₂ H ₅
X-127	O	C ₂ H ₅ NH	C ₂ H ₅
X-128	O	正-C ₃ H ₇ NH	C ₂ H ₅
X-129	O	异-C ₃ H ₇ NH	C ₂ H ₅
X-130	O	正-C ₄ H ₉ NH	C ₂ H ₅
X-131	O	叔-C ₄ H ₉ NH	C ₂ H ₅
X-132	O	PhCH ₂ NH	C ₂ H ₅
X-133	O	PhNH	C ₂ H ₅
X-134	O	CF ₃ CH ₂	C ₂ H ₅
X-135	O	C ₁ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-136	O	C ₁ CH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-137	O	CH ₃ OCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-138	O	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-139	O	CH ₃ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-140	O	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-141	O	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-142	O	CH ₃ OCH(CH ₃)CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-143	O	(CH ₃ O) ₂ CHCH ₂	C ₂ H ₅
X-144	O	HOCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-145	O	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-146	O	CH ₃ (环-C ₃ H ₅)CH	C ₂ H ₅
X-147	O	NCCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-148	S	环-C ₃ H ₅	C ₂ H ₅

化合物	V	R ^{3a}	R ²
X-149	S	CH ₃ NH	C ₂ H ₅
X-150	S	C ₂ H ₅ NH	C ₂ H ₅
X-151	S	正-C ₃ H ₇ NH	C ₂ H ₅
X-152	S	异-C ₃ H ₇ NH	C ₂ H ₅
X-153	S	正-C ₄ H ₉ NH	C ₂ H ₅
X-154	S	叔-C ₄ H ₉ NH	C ₂ H ₅
X-155	S	PhCH ₂ NH	C ₂ H ₅
X-156	S	PhNH	C ₂ H ₅
X-157	S	CF ₃ CH ₂	C ₂ H ₅
X-158	S	C ₁ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-159	S	C ₁ CH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-160	S	CH ₃ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-161	S	CH ₃ CH ₂ OCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-162	S	CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-163	S	C ₂ H ₅ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-164	S	正-C ₄ H ₉ OCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-165	S	CH ₃ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-166	S	(CH ₃) ₂ CHCH ₂	C ₂ H ₅
X-167	S	HOCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-168	S	HOCH ₂ CH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅
X-169	S	CH ₃ (环-C ₃ H ₅)CH	C ₂ H ₅
X-170	S	NCCH ₂ CH ₂	C ₂ H ₅

表 10

对上表的典型实施例进行详细的 ¹H-NMR 光谱分析。除非另有说明，在氘代三氯甲烷中测定 NMR 光谱。

化合物	¹ H-NMR
A-2	3.7-3.9 (2H, m), 5.1-5.2 (2H, m), 5.7-5.9 (1H, m), 7.63 (1H, d), 8.46 (1H, brs), 8.83 (1H, d), 8.91 (1H, d), 10.70 (1H, brs)
A-18	2.26 (1H, t), 4.02 (2H, dd), 7.66 (1H, d), 8.34 (1H, brs), 8.91 (1H, s), 8.94 (1H, d), 10.03 (1H, brs)
A-24	0.5-0.6 (1H, m), 0.7-0.8 (1H, m), 2.6-2.7 (1H, m), 7.65 (1H, d), 8.33 (1H, brs), 8.89 (1H, s), 8.93 (1H, d), 9.68 (1H, brs)
A-26	9.83 (1H, s), 8.93 (1H, d), 8.89 (1H, s), 8.40 (1H, d), 7.65 (1H, d), 4.12 (1H, dt), 2.27 (2H, m), 1.98 (2H, m), 1.73 (2H, m)
A-28	1.4-2.0 (4H, m), 3.8-4.1 (1H, m), 7.64 (1H, d), 8.28 (1H, brd), 8.90 (1H, s), 8.91 (1H, d)
A-30	1.2-1.4 (5H, m), 1.5-1.9 (5H, m), 3.4-3.6 (1H, m), 7.63 (1H, d), 8.22 (1H, brd), 8.89 (1H, s), 8.91 (1H, d)

化合物	¹ H-NMR
A-32	9.68 (1H, s), 8.93 (1H, d), 8.90 (1H, s), 8.38 (1H, t), 7.65 (1H, d), 3.10 (2H, t), 1.00 (1H, m), 0.53 (2H, m), 0.22 (1H, m)
A-37	4.39 (2H, d), 7.1-7.4 (5H, m), 7.62 (1H, d), 8.69 (1H, m), 8.7-9.0 (3H, m)
A-38	1.48 (3H, d), 4.7-4.9 (1H, m), 7.1-7.4 (5H, m), 7.58 (1H, d), 8.78 (1H, brd), 8.86 (1H, s), 8.90 (1H, d)
A-39	2.80 (2H, t), 3.42 (2H, t), 7.1-7.4 (5H, m), 7.62 (1H, d), 8.3-8.5 (1H, m), 8.89 (1H, s), 8.90 (1H, d)
A-62	3.80 (3H, s), 4.31 (1H, s), 6.86 (2H, d), 7.16 (2H, d), 7.62 (1H, d), 8.62 (1H, brs), 8.8-9.0 (2H, m), 10.26 (1H, s)
A-64	3.83 (3H, s), 7.66 (1H, d), 8.89 (1H, s), 8.94 (1H, d), 9.21 (1H, brs), 10.60 (1H, brs)
A-65	10.54 (1H, s), 9.51 (1H, s), 8.94 (1H, d), 8.89 (1H, s), 7.65 (1H, d) 4.01 (2H, q), 1.28 (3H, t)
A-67	10.39 (1H), 8.90-9.05 (2H), 7.81 (1H), 4.18 (1H), 1.24 (6H)
A-71	1.35 (9H, s), 7.62 (1H, d), 8.66 (1H, s), 8.78 (1H, d)
A-74	10.58 (1H, s), 10.04 (1H, s), 8.92 (1H, d), 8.89 (1H, s), 7.65 (1H, d), 5.94 (1H, m), 5.38 (1H, d), 5.35 (1H, d), 4.39 (2H, d)
A-75	10.51 (1H, brs), 8.94 (1H, d), 8.89 (1H, s), 7.65 (1H, d), 5.05 (2H, s), 4.34 (2H, s), 1.81 (3H, s)
A-79	10.45 (1H, brs), 8.96 (1H, d), 8.88 (1H, s), 8.52 (1H, brs), 7.66 (1H, d), 5.85 (1H, m), 5.67 (1H, m), 4.38 (2H, d), 1.77 (3H, d)
A-81	10.74 (1H, brs), 9.37 (1H, brs), 8.93 (1H, d), 8.89 (1H, s), 7.66 (1H, d), 4.56 (2H, s), 2.60 (1H)
A-85	1.33 (3H, t), 4.29 (2H, q), 4.48 (2H, s), 7.64 (1H, d), 8.85 (1H, s), 8.90 (1H, d), 9.60 (1H, brs), 11.11 (1H, brs)
A-86	4.92 (2H, s), 7.3-7.5 (5H, m), 7.63 (1H, d), 8.8-9.0 (2H, m), 9.91 (1H, brs), 10.56 (1H, brs)
A-88	8.29 (1H, d), 8.88 (1H, s), 8.86 (1H, s), 7.65 (1H, d), 7.28 (1H, t), 6.93-6.99 (3H) 4.93 (2H, s), 3.83 (3H, s)
A-89	8.88 (1H, s), 8.76 (1H, d), 8.63 (1H, s), 7.55 (1H, d), 7.36 (2H, d), 6.88 (2H, d), 4.99 (2H, s), 3.79 (3H, s)
A-90	8.97 (1H, d), 8.93 (1H, s), 8.52 (1H, brs), 7.67 (1H, d), 7.35 (2H, t), 7.11 (2H, d), 7.10 (1H, t)
A-149	10.32 (1H, s), 9.53 (1H, s), 8.98-9.01 (2H), 7.68 (1H, d), 7.44 (2H, d), 7.33 (2H, t), 7.15 (1H, t)
A-153	7.0-7.1 (1H, m), 7.2-7.3 (1H, m), 7.3-7.5 (1H, m), 7.68 (1H, d), 7.9-8.1 (1H, m), 8.9-9.1 (2H, m), 9.82 (1H, brs), 10.88 (1H, brs)
A-154	7.0-7.3 (3H, m), 7.51 (1H, s), 7.71 (1H, d), 8.99 (1H, s), 9.03 (1H, d), 10.21 (1H, brs), 10.46 (1H, brs)
A-155	7.2-7.3 (2H, m), 7.4-7.5 (2H, m), 7.69 (1H, d), 8.94 (1H, s), 8.97 (1H, d), 10.26 (1H, brs), 10.42 (1H, brs)

化合物	¹ H-NMR
A-158	7.3-7.4 (2H, m), 7.4-7.5 (2H, m), 7.70 (1H, d), 8.99 (1H, s), 9.02 (1H, d), 9.30 (1H, brs), 10.33 (1H, brs)
A-162	7.2-7.3 (1H, m), 7.5-7.6 (1H, m), 7.6-7.7 (2H, m), 7.93 (1H, d), 8.96 (1H, d), 8.98 (1H, s), 9.68 (1H, brs), 10.72 (1H, brs)
A-170	3.82 (3H, s), 6.8-6.9 (2H, m), 7.3-7.5 (2H, m), 7.68 (1H, d), 8.9-9.0 (2H, m), 9.33 (1H, brs), 10.17 (1H, brs)
A-180	3.99 (3H, s), 7.1-7.2 (1H, m), 7.4-7.6 (1H, m), 7.66 (1H, d), 8.0-8.1 (1H, m), 8.2-8.3 (1H, m), 8.97 (1H, d), 9.00 (1H, s), 9.39 (1H, brs), 12.32 (1H, brs)
A-190	10.42 (1H, s), 9.11 (1H, s), 9.01 (1H, d), 7.86 (1H, d), 7.60 (1H, s), 7.53 (1H, d), 7.31 (1H, t), 7.11 (1H, d), 4.62 (2H)
A-194	7.1-7.3 (2H, m), 7.4-7.5 (2H, m), 7.69 (1H, d), 8.9-9.0 (2H, m), 9.65 (1H, brs), 10.42 (1H, brs)
A-200	6.9-7.1 (4H, m), 7.3-7.4 (2H, m), 7.4-7.5 (2H, m), 7.69 (1H, d), 8.9-9.0 (2H, m), 9.34 (1H, brs), 10.30 (1H, brs)
A-203	10.38 (1H, s), 9.58 (1H, s), 8.98-9.01 (2H), 7.71 (1H, d), 7.59 (2H, d), 7.49 (2H, d), 7.00-7.08 (4H)
A-204	7.2-7.4 (2H, m), 7.70 (1H, d), 8.1-8.2 (1H, m), 8.79 (1H, brs), 8.9-9.1 (2H, m), 10.92 (1H, brs)
A-205	7.0-7.1 (1H, m), 7.3-7.4 (1H, m), 7.71 (1H, d), 7.9-8.0 (1H, m), 8.99 (1H, s), 9.03 (1H, d), 10.08 (1H, brs), 11.05 (1H, brs)
A-206	7.2-7.3 (2H, m), 7.3-7.4 (2H, m), 7.65 (1H, d), 8.92 (1H, d), 8.95 (1H, s), 9.36 (1H, brs), 9.92 (1H, brs)
A-207	7.1-7.2 (1H, m), 7.3-7.4 (1H, m), 7.6-7.7 (1H, m), 7.72 (1H, d), 8.99 (1H, s), 9.03 (1H, d), 10.21 (1H, brs), 10.50 (1H, brs)
A-208	7.1-7.2 (1H, m), 7.4-7.5 (2H, m), 7.72 (1H, d), 8.97 (1H, s), 9.03 (1H, d), 9.13 (1H, brs), 10.45 (1H, brs)
A-209	9.07 (1H, s), 8.97 (1H, d), 8.27 (1H, d), 8.00 (1H, brs), 7.81 (1H, d), 7.74 (1H, t), 7.09 (1H, t)
A-210	10.44 (1H, s), 9.33 (1H, brs), 9.02 (1H, d), 8.99 (1H, s), 8.71 (1H, s), 8.40 (1H, d), 7.98 (1H, d), 7.71 (1H, d), 7.32 (1H, dd)
A-211	10.57 (1H, s), 9.12 (1H, s), 9.02 (1H, d), 8.48 (2H, d), 7.87 (1H, d), 7.63 (2H, d)
A-212	12.48 (1H, brs), 9.63 (1H, brs), 8.88 (1H, d), 8.81 (1H, s), 8.65 (2H, d), 7.61 (1H, d), 7.07 (1H, t)
A-222	7.01 (1H, d), 7.48 (1H, d), 7.71 (1H, d), 8.98 (1H, s), 9.01 (1H, d), 9.92 (1H, brs)
A-223	7.72 (1H, d), 8.33 (1H, s), 8.87 (1H, s), 8.98 (1H, s), 9.01 (1H, d), 10.18 (1H, brs)
A-248	3.8-4.0 (2H, m), 7.67 (1H, d), 8.6-8.8 (1H, m), 8.91 (1H, s), 8.96 (1H, s), 9.80 (1H, brs)
A-250	1.9-2.1 (2H, m), 3.3-3.5 (2H, m), 3.5-3.7 (2H, m), 7.65 (1H, d), 8.43 (1H, brs), 8.90 (1H, s), 8.93 (1H, d), 10.35 (1H, brs)

化合物	¹ H-NMR
A-251	3.39 (3H, s), 3.4-3.6 (4H, m), 7.65 (1H, d), 8.43 (1H, brs), 8.90 (1H, s), 8.94 (1H, d), 9.02 (1H, brs)
A-255	0.92 (3H, t), 1.3-1.5 (2H, m), 1.5-1.7 (2H, m), 1.7-1.9 (2H, m), 3.2-3.6 (6H, m), 7.63 (1H, d), 8.45 (1H, brs), 8.89 (1H, s), 8.91 (1H, d), 10.00 (1H, brs)
A-256	3.3-3.6 (m, 8H), 4.44 (1H, t), 7.65 (1H, d), 8.40 (1H, brs), 8.90 (1H, s), 8.93 (1H, s), 9.40 (1H, brs)
A-260	3.4-3.5 (2H, m), 3.7-3.9 (2H, m), 7.67 (1H, d), 8.58 (1H, brs), 8.91 (1H, s), 8.95 (1H, d), 9.22 (1H, brs)
A-261	10.89 (1H, s), 8.89-8.93 (2H), 8.55 (1H, d), 7.66 (1H, d), 3.32- 3.64 (4H), 1.71-1.76 (2H)
A-262	3.78 (3H, s), 3.98 (2H, d), 7.64 (1H, d), 8.7-8.9 (1H, m), 8.89 (1H, s), 8.92 (1H, d), 10.31 (1H, brs)
A-265	4.43 (2H, d), 7.84 (1H, d), 8.81 (1H, brs), 9.00 (1H, d), 9.08 (1H, s)
A-267	8.97 (1H, d), 8.93 (1H, s), 8.60 (1H, s), 7.67 (1H, d), 1.74 (6H, s)
A-268	1.0-1.2 (6H, m), 1.61 (3H, s), 2.1-2.3 (1H, m), 7.66 (1H, d), 8.73 (1H, brs), 8.94 (1H, s), 8.96 (1H, d), 10.05 (1H, brs)
A-274	1.5-1.7 (4H, m), 2.3-2.6 (6H, m), 3.2-3.4 (2H, m), 7.62 (1H, d), 8.5-8.7 (1H, m), 8.8-9.0 (2H, m), 10.40 (1H, brs)
A-292	1.0-1.9 (10H, m), 2.88 (3H, s), 3.7-4.0 (1H, m), 7.55 (1H, d), 8.74 (1H, s), 8.82 (1H, d)
A-296	2.98 (3H, s), 4.52 (2H, s), 7.2-7.4 (5H, m), 7.57 (1H, d), 8.52 (1H, brs), 8.74 (1H, s), 8.34 (1H, d)
A-312	3.11 (3H, s), 7.73 (1H, d), 8.74 (1H, s), 8.87 (1H, s), 9.39 (1H, s), 9.79 (1H, brs)
A-313	3.13 (3H, s), 3.79 (3H, s), 7.57 (1H, d), 8.72 (1H, s), 8.85 (1H, d), 8.90 (1H, brs)
A-316	1.32 (6H, d), 3.12 (3H, s), 4.1-4.3 (1H, m), 7.56 (1H, d), 8.70 (1H, s), 8.78 (1H, brs), 8.84 (1H, d)
A-317	3.17 (3H, s), 4.40 (2H, d), 5.3-5.6 (2H, m), 5.9-6.1 (1H, m), 7.57 (1H, d), 8.68 (1H, s), 8.84 (1H, d)
A-326	1.50 (1H, s), 3.09 (3H, s), 3.83 (3H, s), 5.54 (1H, q), 7.58 (1H, d), 8.78 (1H, s), 8.85 (1H, d)
A-329	3.13 (3H, s), 4.88 (2H, s), 7.3-7.5 (5H, m), 7.53 (1H, d), 8.43 (1H, s), 8.59 (1H, brs), 8.82 (1H, d)
A-331	3.17 (3H, s), 7.81 (1H, d), 8.96 (1H, d), 9.13 (1H, s), 10.22 (1H, brs)
A-349	8.84 (1H, d), 8.69 (1H, s), 7.69 (1H, brs), 7.50-7.59 (4H), 7.29 (2H, d), 3.21 (3H, s)
A-353	8.84 (1H, d), 8.70 (1H, s), 7.55-7.62 (2H), 7.24-7.46 (3H), 3.16 (3H, s)
A-354	8.84 (1H, d), 8.70 (1H, s), 7.57 (1H, d), 7.45-7.48 (2H), 7.32 (1H), 7.20 (1H), 3.21 (3H, s)

化合物	¹ H-NMR
A-355	8.84 (1H, d), 8.69 (1H, s), 7.57 (1H, s), 7.50 (2H, d), 7.24 (2H, d), 3.20 (3H, s)
A-365	8.84 (1H, d), 8.67 (1H, s), 7.55-7.58 (2H), 7.27-7.39 (2H), 7.22 (1H, d), 3.13 (3H, s), 2.30 (3H, s)
A-366	8.82 (1H, d), 8.67 (1H, s), 7.77 (1H, s), 7.56 (1H, d), 7.38 (1H, t), 7.23 (1H, d), 7.06-7.10 (2H), 3.18 (3H, s), 2.41 (3H, s)
A-367	8.84 (1H, d), 8.68 (1H, s), 7.61 (1H, s), 7.56 (1H, d), 7.30 (2H, d), 7.16 (2H, d), 3.18 (3H, s), 2.42 (3H, s)
A-369	8.80 (1H, d), 8.66 (1H, s), 7.91 (1H, s), 7.55 (1H, d), 7.39 (1H, t), 6.93 (1H, dd), 6.86 (1H, d), 6.79 (1H, d), 3.83 (3H, s), 3.19 (3H, s)
A-373	8.89 (1H, d), 8.85 (1H, s), 8.29 (2H, d), 7.80 (1H, d), 7.73 (2H, d), 3.41 (3H, s)
A-381	8.86 (1H, d), 8.73 (1H, s), 7.73 (1H, d), 7.29 (1H, t), 6.83-6.92 (3H), 3.19 (3H, s)
A-398	13.93 (1H, s), 8.84 (1H, d), 8.75 (1H, s), 8.37 (1H, d), 7.83 (1H, t), 7.58 (1H, d), 7.09-7.16 (2H), 3.36 (3H, s)
A-431	3.51 (2H, t), 3.64 (2H, t), 7.59 (1H, d), 8.78 (1H, s), 8.82 (1H, d), 10.38 (1H, brs)
A-519	1.11 (3H, t), 3.2-3.4 (2H, m), 3.4-3.6 (2H, m), 3.7-3.9 (2H, m), 7.56 (1H, d), 8.73 (1H, s), 8.80 (1H, d)
A-524	0.85 (3H, t), 1.4-1.7 (2H, m), 3.1-3.3 (2H, m), 3.4-3.6 (2H, m), 3.7-3.9 (2H, m), 4.82 (1H, brs), 7.56 (1H, d), 8.72 (1H, s), 8.78 (1H, d), 10.54 (1H, brs)
A-529	8.82 (1H, d), 8.62 (1H, s), 8.73 (1H, brs), 7.54 (1H, d), 7.25-7.60 (5H), 4.40-4.58 (3H), 1.16 (6H)
A-540	1.16 (6H, d), 4.2-4.5 (1H, m), 7.63 (1H, d), 8.68 (1H, s), 8.82 (1H, d), 9.02 (1H, brs)
A-544	8.84 (1H, d), 8.69 (1H, s), 7.56 (1H, d), 4.10-4.25 (2H), 1.34 (3H, d), 1.21 (3H, d)
A-564	8.82 (1H, d), 8.67 (1H, s), 7.50-7.57 (3H), 7.15-7.26 (3H), 4.65 (1H, m), 1.03 (6H, d)
A-605	1.10 (6H, d), 3.3-3.5 (2H, m), 3.8-4.0 (2H, m), 4.3-4.5 (1H, m), 7.54 (1H, d), 8.79 (1H, s), 8.80 (1H, d)
A-626	8.88 (1H, d), 8.73 (1H, s), 7.60 (1H, d), 6.41 (1H, brs), 1.17 (9H, s)
A-691	8.82 (1H, d), 8.65 (1H, s), 7.53 (1H, d), 3.95 (2H, t), 3.58 (2H, t), 1.36 (9H, s)
A-697	8.82 (1H, d), 8.75 (1H, brs), 8.71 (1H, s), 7.56 (1H, s), 5.75 (2H, m), 5.19-5.30 (4H), 3.29 (4H, d)
A-713	8.97 (1H, s), 8.84 (1H, d), 8.73 (1H, s), 7.57 (1H, d), 5.79 (1H, m), 5.26 (1H, d), 5.24 (1H, d), 4.11 (2H, d), 3.78 (3H, s)
A-736	8.83 (1H, d), 8.69 (1H, s), 7.45-7.58 (5H), 7.24-7.28 (2H), 5.78 (1H, m), 5.12 (1H, d), 5.08 (1H, d), 4.17 (2H, d),

化合物	¹ H-NMR
A-737	8.84 (1H, d), 8.71 (1H, s), 7.55-7.62 (2H), 7.27-7.45 (3H), 5.80 (1H, m), 5.09 (1H, d), 5.06 (1H, d), 4.49 (1H, dd), 3.81 (1H, dd)
A-738	8.84 (1H, d), 8.70 (1H, s), 7.57 (1H, d), 7.43-7.45 (2H), 7.24- 7.28 (1H, d), 7.16 (1H, dd), 5.77 (1H, m), 5.14 (1H, d), 5.10 (1H, d), 4.16 (2H, d)
A-744	8.81 (1H, d), 8.69 (1H, s), 7.68 (1H, d), 7.34 (1H, t), 6.88-6.95 (3H), 5.77 (1H, m), 5.05 (1H, d), 5.02 (1H, d), 4.19 (2H, d), 3.80 (3H, s)
A-745	8.83 (1H, d), 8.68 (1H, s), 7.56 (1H, d), 7.15 (2H, d), 6.98 (2H, d), 5.76 (1H, m), 5.10 (1H, d), 5.06 (1H, d), 4.12 (2H, d), 3.86 (3H, s)
A-747	8.85 (1H, d), 8.70-8.721 (2H), 7.72 (1H, d), 7.28 (1H, t), 6.82- 6.89 (3H), 5.82 (1H, m), 5.03-5.14 (2H), 4.20 (2H, d)
A-748	8.80 (1H, d), 8.68 (1H, s), 7.84 (1H, s), 7.59 (1H, d), 7.07 (2H, d), 6.89 (2H, d), 5.77 (1H, m), 5.00-5.30 (2H), 4.11 (2H, d)
A-798	4.61 (2H, s), 7.2-7.4 (5H, m), 7.54 (1H, d), 8.54 (1H, s), 8.62 (1H, d), 9.18 (1H, brs), 10.38 (1H, brs)
A-799	8.95 (1H, s), 8.86 (1H, d), 8.73 (1H, s), 7.57 (1H, d), 7.24-7.36 (5H), 4.65 (2H, s), 3.68 (3H, s)
A-805	8.80 (1H, d), 8.45 (1H, s), 7.53 (1H, d), 7.23-7.41 (10H), 4.75 (2H, s), 4.64 (2H, s)
A-822	8.86 (1H, d), 8.71 (1H, s), 7.58 (2H), 7.42 (3H), 7.24 (3H), 7.04- 7.11 (4H), 4.76 (2H, s)
A-861	9.30 (1H, s), 8.81 (1H, d), 8.73 (1H, s), 7.55 (1H, d), 4.38 (1H, m), 3.83 (1H, d), 3.03 (1H, t), 1.50-1.75 (6H), 1.22 (3H, d)
A-862	3.3-3.5 (2H, m), 3.6-3.8 (2H, m), 4.47 (2H, s), 7.1-7.4 (5H, m), 7.57 (1H, d), 8.73 (1H, s), 8.79 (1H, d)
A-864	8.79 (1H, d), 8.72 (1H, s), 7.56 (1H, d), 4.45 (1H, brs), 3.20-3.80 (4H), 1.90-2.10 (2H)
A-865	8.84 (1H, d), 8.74 (1H, s), 8.42 (1H, brs), 7.57 (1H, d), 5.87 (2H, brd), 4.33 (2H, s), 4.18 (2H, s)
A-866	11.32 (1H, brs), 9.18 (1H, s), 9.05 (1H, d), 7.97 (1H, d), 7.96 (1H, d), 7.94 (1H, d), 7.47 (1H, t), 7.33 (1H, t)
A-867	8.86 (1H, d), 8.78 (1H, s), 7.71 (1H, d), 7.25-7.45 (10H)
A-869	3.6-3.9 (4H, m), 7.2-7.6 (6H, m), 8.67 (1H, d), 8.79 (1H, m)
A-871	1.7-2.2 (4H, m), 3.2-3.7 (4H, m), 7.56 (1H, d), 8.73 (1H, s), 8.81 (1H, d), 9.11 (1H, brs)
A-872	1.5-1.8 (6H, m), 3.3-3.6 (4H, m), 7.56 (1H, d), 8.75 (1H, s), 8.83 (1H, d), 8.93 (brs)
A-873	3.4-3.6 (4H, m), 3.6-3.9 (4H, m), 7.58 (1H, d), 8.03 (1H, brs), 8.76 (1H, s), 8.86 (1H, d)
A-874	2.6-2.8 (4H, m), 4.7-4.9 (4H, m), 7.59 (1H, d), 8.77 (1H, s), 8.86 (1H, d)

化合物	¹ H-NMR
B-37	4.85 (2H, d), 7.2-7.5 (5H, m), 7.62 (1H, d), 8.85 (1H, s), 8.92 (1H, d), 9.74 (1H, brs), 10.61 (1H, brs)
B-40	10.83 (1H, s), 8.95 (1H, d), 8.91 (1H, s), 8.78 (1H, s), 7.65 (1H, d), 7.25-7.67 (5H), 1.91 (6H)
B-47	10.58 (1H), 9.14 (1H, s), 8.97 (1H, d), 8.90 (1H, s), 7.67 (1H, d), 7.24-7.38 (4H), 4.86 (2H, d)
B-64	3.84 (3H, s), 7.79 (1H, s), 8.84 (1H, s), 8.93 (1H, d), 10.78 (1H, brs)
B-65	12.41 (1H, s), 10.66 (1H, s), 8.93 (1H, s), 8.87 (1H, d), 7.70 (1H, d), 4.07 (2H, q), 1.16 (3H, t)
B-71	12.14 (1H, s), 9.22 (1H, s), 8.98 (1H, d), 8.92 (1H, s), 7.68 (1H, d), 1.43 (9H, s)
B-74	12.53 (1H, s), 10.79 (1H, s), 9.00 (1H, s), 8.95 (1H, d), 7.79 (1H, d), 6.02 (1H, m), 5.38 (1H, d), 5.28 (1H, d), 4.60 (2H, d)
B-86	12.22 (1H, s), 9.22 (1H, brs), 8.95 (1H, d), 8.86 (1H, s), 7.66 (1H, d), 7.37-7.44 (5H), 5.14 (2H, s)
B-100	2.84 (1H, brs), 3.36 (1H, brs), 7.87 (1H, d), 8.28 (1H, brs), 9.03 (1H, d), 9.17 (1H, s)
B-108	5.40 (2H, s), 7.2-7.5 (5H, m), 7.71 (1H, d), 8.9-9.1 (2H, m), 12.80 (1H, brs)
B-109	6.8-7.1 (4H, m), 7.3-7.4 (1H, m), 7.65 (1H, d), 8.90 (1H, s), 8.96 (1H, d), 8.49 (1H, brs), 11.82 (1H, d)
B-149	12.34 (1H, s), 10.95 (1H, brs), 9.14 (1H, s), 9.02 (1H, d), 7.86 (1H, d), 7.81 (2H, d), 7.44 (2H, t), 7.29 (1H, m)
B-150	12.35 (1H, s), 11.15 (1H, brs), 9.16 (1H, s), 9.03 (1H, d), 8.34 (1H, t), 7.87 (1H, d), 7.25-7.35 (3H)
B-151	12.45 (1H, s), 9.14 (1H, s), 9.02 (1H, d), 7.49 (1H), 7.47 (1H, d), 7.46-7.50 (2H), 7.07 (1H, m)
B-152	12.25 (1H, s), 11.03 (1H, brs), 9.12 (1H, s), 9.02 (1H, d), 7.86 (1H, d), 7.78 (2H, t), 7.21 (2H, t)
B-155	9.09 (1H, s), 8.98 (1H, d), 7.83 (1H, d), 7.78 (2H, d), 7.44 (2H, d)
B-158	9.13 (1H, s), 9.02 (1H, d), 7.87 (1H, d), 7.79 (2H, d), 7.62 (2H, d)
B-163	7.5-7.6 (2H, m), 7.67 (1H, d), 7.8-7.9 (1H, m), 8.01 (1H, d), 8.91 (1H, s), 8.95 (1H, s), 9.82 (1H, brs), 12.25 (1H, brs)
B-166	9.00 (1H, s), 8.90 (1H, d), 7.74 (1H, d), 7.52 (1H, d), 7.45 (1H, s), 7.19 (1H, t), 6.99 (1H, d), 2.25 (3H, s)
B-167	12.29 (1H, s), 10.94 (1H, brs), 9.13 (1H, s), 9.01 (1H, d), 7.86 (1H, d), 7.66 (2H, d), 7.25 (2H, d), 2.34 (3H, s)
B-168	3.97 (3H, s), 6.9-7.3 (3H, m), 7.88 (1H, d), 8.8-8.9 (1H, m), 9.03 (1H, d), 9.15 (1H, s), 10.95 (1H, brs), 12.73 (1H, brs)

化合物	¹ H-NMR
B-169	3.83(3H, s), 6.8-6.9(1H, m), 7.2-7.4(2H, m), 7.6-7.7(1H, m), 7.86(1H, d), 9.01(1H, d), 9.13(1H, s), 10.97(1H, brs), 12.38(1H, brs)
B-170	3.79(3H, s), 6.95(2H, d), 7.63(2H, d), 7.83(1H, d), 8.98(1H, d), 9.08(1H, s), 10.93(1H, brs), 12.17(1H, brs)
B-176	9.14(1H, s), 9.03(1H, d), 8.12(2H, d), 7.88(1H, d), 7.85(2H, d)
B-184	12.35(1H, s), 10.96(1H, brs), 9.13(1H, s), 9.02(1H, d), 8.58(1H, s), 7.86(1H, d), 7.53(1H, s), 7.25(1H, t), 7.15(1H, t), 6.76(1H, d)
B-185	12.14(1H, s), 10.92(1H, brs), 9.12(1H, s), 9.20(1H, d), 8.54(1H, brs), 7.85(1H, d), 7.56(2H, d), 6.89(2H, d)
B-189	4.71(2H, s), 7.2-7.4(2H, m), 7.5-7.6(1H, m), 7.8-7.9(2H, m), 9.01(1H, d), 9.11(1H, s), 11.01(1H, brs), 12.13(1H, brs)
B-190	12.38(1H, s), 10.98(1H), 9.15(1H, s), 9.03(1H, d), 7.87(1H, d), 7.74(1H, d), 7.73(1H, s), 7.41(1H, t), 7.30(1H, d), 4.69(3H, s)
B-194	12.37(1H, brs), 9.13(1H, s), 9.03(1H, d), 7.92(2H, d), 7.87(1H, d), 7.42(2H, d)
B-209	9.99(1H, s), 9.18(1H, s), 9.04(1H, d), 8.48-8.55(3H), 7.88(1H, d)
B-247	7.5-8.0(6H, m), 8.99(1H, d), 9.01(1H, s), 10.64(1H, brs)
B-251	3.42(3H, s), 3.65(2H, t), 3.8-4.0(2H, m), 7.66(1H, d), 8.89(1H, s), 8.96(1H, d), 9.22(1H, brs), 10.48(1H, brs)
B-255	0.91(3H, t), 1.3-1.5(2H, m), 1.5-1.7(2H, m), 1.9-2.1(2H, m), 3.46(3H, t), 3.56(3H, t), 3.81(2H, q), 7.66(1H, d), 8.89(1H, s), 8.97(1H, d), 9.02(1H, brs), 10.53(1H, brs)
B-257	1.99(3H, s), 7.88(1H, d), 8.97(1H, d), 8.99(1H, s), 10.92(1H, brs), 12.92(1H, brs)
B-258	7.5-7.7(3H, m), 7.86(1H, s), 7.9-8.1(2H, m), 9.02(1H, d), 9.14(1H, brs)
B-259	7.3-7.5(5H, m), 7.5-7.7(5H, m), 7.77(1H, d), 8.8-9.0(2H, m), 13.05(1H, brs)
B-261	1.8-2.0(2H, m), 3.76(2H, t), 3.8-3.9(2H, m), 7.66(1H, m), 8.99(1H, s), 8.95(1H, d), 9.44(1H, brs), 10.53(1H, brs)
B-267	9.08(1H, s), 9.01(1H, d), 7.84(1H, d), 1.95(6H, s)
B-269	10.38(1H, brs), 9.35(1H, s), 8.96(1H, d), 8.90(1H, s), 7.67(1H, d), 3.73(4H), 1.60-1.80(4H)
B-296	3.23(3H, s), 5.22(2H, s), 7.22-7.5(5H, m), 7.63(1H, d), 8.7-9.0(2H, m)
B-313	9.40(1H, s), 8.95(1H, d), 8.75(1H, s), 7.57(1H, d), 3.86(3H, s), 3.58(3H, s)
B-331	3.37(3H, s), 4.70(1H, s), 7.53(1H, d), 8.62(1H, s), 8.80(1H, d)
B-349	3.69(1H, s), 7.3-7.6(6H, m), 8.33(1H, brs), 8.51(1H, s),

化合物	¹ H-NMR
	8.79 (1h, d)
B-353	8.81 (1H, d), 8.52 (1H, s), 8.52 (1H, s), 7.53-7.60 (2H), 7.25-7.46 (3H), 3.62 (3H, s)
B-354	10.13 (1H), 8.88 (1H, d), 8.48 (1H, s), 7.72 (1H, d), 7.37-7.55 (4H), 3.75 (3H, s)
B-355	8.84 (1H, d), 8.57 (1H, s), 8.15 (1H, s), 7.56 (1H, d), 7.43 (2H, d), 7.27 (2H, d), 3.68 (3H, s)
B-366	8.81 (1H, d), 8.58 (1H, s), 8.14 (1H, s), 7.54 (1H, d), 7.37 (1H, d), 7.25 (1H), 7.10 (2H), 3.65 (3H, s), 2.42 (3H, s)
B-369	8.47 (1H, d), 8.03 (1H, s), 7.33 (1H, d), 7.02 (1H, t), 6.54-6.64 (3H), 3.45 (3H, s), 3.32 (3H, s)
B-373	8.87 (1H, d), 8.62 (1H, s), 8.35 (1H, s), 8.31 (2H, d), 7.57 (1H, d), 7.53 (2H, d), 3.78 (3H, s)
B-398	8.89 (1H, d), 8.72 (1H, s), 8.51 (1H, d), 7.98 (1H, dd), 7.73 (1H, d), 7.58 (1H, d), 7.31 (1H, dd), 3.79 (3H, s)
B-417	9.15 (1H, s), 8.88 (1H, d), 7.69 (1H, d), 4.16 (3H, s), 3.56 (3H, s)
B-431	3.38 (3H, s), 3.7-4.2 (4H, m), 7.5-7.7 (1H, m), 8.7-9.0 (2H, m), 10.35 (1H, brs)
B-519	1.2-1.4 (3H, m), 3.7-4.1 (6H, m), 7.56 (1H, d), 8.6-9.0 (2H, m), 10.85 (1H, brs)
B-564	9.08 (1H, brs), 8.36 (1H, d), 7.51 (1H, brs), 7.23 (1H, d), 7.04-7.30 (3H), 6.86-6.91 (2H), 5.17 (1H), 0.74 (6H, d)
B-713	9.45 (1H, s), 8.85 (1H, d), 8.76 (1H, s), 7.56 (1H, d), 5.90 (1H, m), 5.27-5.36 (2H), 4.70 (2H, d), 3.86 (3H, s)
B-736	8.85 (1H, s), 8.27 (1H, s), 7.69 (1H, d), 7.30-7.50 (5H), 6.10 (1H, m), 5.28 (1H, d), 5.17 (1H, d), 4.89 (2H, d)
B-737	8.83 (1H, d), 8.12 (1H, s), 7.69 (1H, d), 7.54-7.65 (2H), 7.38-7.45 (2H), 6.05 (1H, m), 5.24 (1H, d), 5.21 (1H, d), 5.00 (1H, dd), 4.73 (1H, dd)
B-738	10.15 (1H), 8.86 (1H, d), 8.40 (1H, s), 7.71 (1H, d), 7.35-7.54 (4H), 6.00 (1H, m), 5.27 (1H, d), 5.22 (1H, d), 4.93 (1H, d)
B-744	8.80 (1H, d), 8.59 (1H, s), 8.11 (1H, s), 7.53 (1H, d), 7.41 (1H, t), 6.96 (1H, dd), 6.84 (1H, dd), 6.77 (1H), 5.94 (1H, m), 5.20 (1H, d), 5.17 (1H, d), 4.73 (2H, d), 3.84 (3H, s)
B-745	8.80 (1H, d), 8.67 (1H, s), 8.13 (1H, s), 7.53 (1H, d), 7.17 (2H, d), 6.98 (2H, d), 5.93 (1H, m), 5.17 (1H, d), 5.14 (1H, d), 4.72 (2H, d), 3.85 (3H, s)
B-747	8.79 (1H, d), 8.51 (1H, s), 8.34 (1H, s), 7.56 (1H, d), 7.33 (1H, t), 7.26 (1H, s), 6.87 (1H, dd), 6.79 (1H, dd), 6.74 (1H, s), 5.91 (1H, m), 5.21 (1H, d), 5.17 (1H, d), 4.73 (2H, d)

化合物	¹ H-NMR
B-748	9.69 (1H, s), 8.80 (1H, d), 7.96 (1H, s), 7.66 (1H, d), 7.19 (2H, d), 6.86 (2H, d), 5.93 (1H, m), 5.12-5.25 (2H), 4.89 (2H, d)
B-799	10.45 (1H, brs), 8.90 (1H, d), 8.86 (1H, s), 7.76 (1H, d), 7.30-7.46 (5H), 5.41 (2H, s), 3.88 (3H, s)
B-805	8.80 (1H, d), 8.69 (1H, s), 8.45 (1H, s), 7.53 (1H, d), 7.23-7.41 (10H), 4.75 (2H, s), 4.64 (2H, s)
B-822	9.90 (1H), 8.84 (1H, d), 8.25 (1H, s), 7.70 (1H, d), 7.24-7.45 (10H), 5.62 (2H, s)
B-861	9.96 (1H, brs), 8.95 (1H, s), 8.93 (1H, d), 7.79 (1H, d), 5.40 (1H, brs), 4.23 (1H, brs), 3.34 (1H), 1.60-1.94 (6H), 1.33 (3H, d)
B-863	8.86-8.95 (2H), 7.65 (1H, d), 5.62 (1H), 3.85-4.35 (4H), 2.35-2.65 (2H)
B-864	8.93-8.98 (2H), 7.79 (1H, d), 4.75 (1H), 3.70-4.00 (4H), 1.95-2.25 (2H)
B-865	8.93 (2H), 8.42 (1H, brs), 7.64 (1H, d), 5.9 (2H, m), 4.64 (2H, s), 4.57 (2H, s)
B-867	8.81 (1H, d), 8.54 (1H, s), 8.49 (1H, s), 7.54 (1H, d), 7.28-7.45 (10H)
B-868	10.10 (1H, s), 8.90 (1H, d), 8.82 (1H, s), 7.76 (1H, d), 7.30-7.53 (5H), 2.04 (3H, s)
B-870	10.38 (1H,), 9.37 (1H, s), 8.96 (1H, d), 8.89 (1H, s), 7.67 (1H, d), 4.30 (2H), 3.74 (2H), 3.04 (3H, s), 1.85-1.90 (4H)
B-871	1.9-2.2 (4H, m), 3.7-4.0 (4H, m), 7.62 (1H, d), 8.8-9.0 (2H, m)
B-872	1.6-1.9 (6H, m), 3.6-3.8 (2H, m), 4.0-4.3 (2H, m), 7.63 (2H, d), 8.87 (1H, brs), 8.9-9.0 (2H, m)
B-873	3.5-4.5 (6H, m), 7.64 (1H, d), 8.56 (1H, brs), 8.92 (1H, s), 8.94 (1H, d)
B-874	8.94 (1H, d), 8.93 (1H, s), 7.65 (1H, d), 4.40 (2H, brs), 4.02 (2H, brs), 2.86 (4H)
B-877	3.07 (2H, dt), 3.96 (2H, t), 7.06 (1H, s), 7.74 (1H, d), 8.73 (1H, s), 8.87 (1H, d)
B-880	1.87 (6H, d), 7.2-7.8 (6H, m), 8.77 (1H, s), 8.83 (1H, d)
C-10	3.08 (3H, s), 4.57 (2H, s), 7.2-7.5 (5H, m), 7.64 (1H, d), 8.72 (1H, s), 8.89 (1H, d), 9.34 (1H, brs)
C-78	3.10 (3H, s), 3.26 (3H, d), 4.5-4.8 (2H, m), 7.1-7.5 (5H, m), 7.64 (1H, d), 8.72 (1H, s), 8.90 (1H, d), 9.34 (1H, brs)
C-85	3.02 (3H, s), 3.34 (3H, s), 3.64 (3H, s), 7.58 (1H, d), 8.65 (1H, d), 8.81 (1H, d)
C-91	2.88 (3H, s), 2.98 (3H, s), 4.72 (2H, s), 7.30-7.43 (5H), 7.59 (1H, d), 8.52 (1H, s), 8.80 (1H, d)
D-85	1.33 (1H, t), 2.98 (3H, s), 3.61 (3H, s), 3.87 (1H, q), 7.60 (1H, d), 8.67 (1H, s), 8.82 (1H, d)

化合物	¹ H-NMR
D-86	1.2-1.4 (6H, m), 3.7-4.0 (4H, m), 7.59 (1H, d), 8.67 (1H, d), 8.81 (1H, d)
E-85	2.97 (3H, s), 3.59 (3H, s), 4.42 (2H, d), 5.28 (1H, d), 5.32 (1H, d), 5.98 (1H, m), 7.61 (1H, d), 8.68 (1H, s), 8.83 (1H, d)
E-87	3.00 (3H, s), 4.25 (2H, d), 4.37 (2H, d), 5.2-5.5 (4H, m), 5.7-6.1 (2H, m), 7.61 (1H, d), 8.68 (1H, s), 8.82 (1H, d)
F-85	2.35 (1H, t), 3.09 (3H, s), 3.68 (3H, s), 4.64 (2H, d), 7.62 (1H, d), 8.68 (1H, s), 8.85 (1H, d)
F-88	2.37 (1H, dd), 2.62 (1H, dd), 3.12 (3H, s), 4.50 (2H, d), 4.61 (2H, d), 7.63 (1H, d), 8.73 (1H, s), 8.86 (1H, d)
G-35	4.66 (2H, s), 4.75 (2H, s), 7.24-7.42 (10H), 7.43 (1H, d), 8.46 (1H, s), 8.83 (1H, d)
G-85	2.81 (3H, s), 3.08 (3H, s), 5.06 (2H, s), 7.26-7.32 (3H), 7.45 (2H, d), 7.59 (1H, d), 8.70 (1H, s), 8.82 (1H, d)
G-91	2.71 (3H, s), 4.29 (2H, s), 4.71 (2H, s), 7.0-7.1 (2H, m), 7.2-7.6 (8H, m), 7.58 (1H, d), 8.56 (1H, s), 8.80 (1H, d)
G-126	4.31 (2H, s), 4.38 (2H, s), 4.71 (2H, s), 6.89 (2H, d), 7.07 (2H), 7.17-7.39 (11H), 7.50 (1H, d), 8.39 (1H, s), 8.58 (1H, d)
H-85	2.96 (3H, s), 3.64 (3H, s), 3.81 (3H, s), 4.59 (2H, s), 7.62 (1H, d), 8.80 (1H, s), 8.85 (1H, d)
H-89	3.08 (3H, S), 3.74 (3H, s), 3.77 (3H, s), 4.48 (2H, s), 4.60 (2H, s), 7.64 (1H, s), 8.84 (1H, s), 8.87 (1H, d)
H-91	2.90 (3H, s), 3.69 (3H, s), 4.76 (2H, s), 7.24-7.45 (5H), 7.64 (1H, d), 8.80 (1H, s), 8.85 (1H, d)
I-85	1.60 (3H, d), 3.63 (3H, s), 3.80 (3H, s), 5.30 (1H, q), 7.58 (1H, d), 8.78 (1H, s), 8.84 (1H, d)
S-2	0.87 (3H, t), 1.4-1.7 (2H, m), 3.17 (2H, t), 3.54 (2H, t), 4.06 (2H, t), 7.54 (1H, d), 8.65 (1H, s), 8.81 (1H, d)
S-3	1.15 (6H, d), 3.49 (2H, t), 3.9-4.2 (3H, m), 7.54 (1H, d), 8.66 (1H, s), 8.81 (1H, d)
S-7	1.34 (9H, s), 3.58 (2H, t), 3.96 (2H, t), 7.53 (1h, d), 8.65 (1h, s), 8.81 (1h, d)
S-15	3.40 (2H, t), 4.01 (2H, t), 4.53 (2H, s), 7.1-7.4 (5H, m), 7.57 (1h, d), 8.69 (1H, s), 8.83 (1H, d)
S-18	4.00 (2H, t), 4.18 (2H, t), 7.1-7.5 (5H, m), 7.57 (1H, d), 8.70 (1H, s), 8.83 (1H, d)
S-109	1.25 (3H, q), 3.1-3.3 (1H, d), 3.4-3.6 (1H, m), 3.7-4.0 (2H, m), 4.28 (1H, d), 4.47 (1H, d), 5.76 (1H, d), 7.1-7.5 (5H, m), 7.57 (1H, d), 8.70 (1H, s), 8.83 (1H, d)
S-120	1.37 (6H, d), 4.2-4.4 (1H, m), 4.42 (2H, s), 7.62 (1H, d), 8.73 (1H, s), 8.91 (1H, d)
S-124	1.55 (9H, s), 4.34 (2H, s), 7.60 (1H, d), 8.71 (1H, s), 8.90 (1H, d)

化合物	¹ H-NMR
S-132	4.47 (2H, s), 4.62 (2H, s), 7.2-7.4 (4H, m), 7.61 (1H, d), 8.70 (1H, s), 8.91 (1H, d)
S-143	1.36 (6H, d), 1.70 (3H, d), 4.3-4.4 (1H, m), 4.67 (1H, q), 7.60 (1H, d), 8.71 (1H, s), 8.90 (1H, d)
S-155	1.71 (3H, d), 4.76 (2H, s), 4.76 (1H, q), 7.1-7.4 (5H, m), 7.61 (1H, d), 8.69 (1H, s), 8.91 (1H, d)
S-167	1.35 (6H, d), 1.78 (6H, s), 4.2-4.4 (1H, m), 7.58 (1H, d), 8.67 (1H, s), 8.88 (1H, d)
S-356	3.77 (2H, t), 4.40 (2H, t), 6.81 (1H, brs), 7.54 (1H, d), 8.65 (1H, s), 8.82 (1H, d)
S-357	0.94 (3H, t), 1.34 (1H, m), 1.60 (1H, m), 3.63 (2H, t), 3.76 (2H, t), 4.23 (2H, t), 7.51 (1H, d), 8.62 (1H, s), 8.79 (1H, d)
S-548	3.69 (2H, t), 3.77 (3H, s), 4.00 (2H, t), 7.57 (1H, d), 8.67 (1H, s), 8.86 (1H, d)
S-549	3.43 (2H, t), 3.88 (2H, t), 4.90 (2H, s), 7.30-7.40 (5H), 7.57 (1H, d), 8.67 (1H, s), 8.85 (1H, d)
S-550	1.40 (3H, d), 4.09 (1H, m), 4.34 (1H, m), 4.64 (1H, m), 7.55 (1H, d), 8.78 (1H, d), 9.14 (1H, s), 9.47 (1H, brs)
S-551	1.03 (3H, t), 1.76 (2H, m), 4.19 (2H, m), 4.63 (1H, m), 7.56 (1H, d), 8.80 (1H, d), 9.17 (1H, s), 9.49 (1H, brs)
S-552	0.88 (3H, t), 1.80 (2H, m), 3.82 (1H, m), 4.17 (1H, d), 4.30 (1H, dd), 4.63 (1H, t), 5.12 (1H, d), 7.23-7.38 (5H), 7.53 (1H, d), 8.75 (1H, d), 9.10 (1H, s)
S-553	4.38 (1H, dd), 4.90 (1H, t), 5.27 (1H), 7.25-7.53 (5H), 7.57 (1H, d), 8.81 (1H, d), 9.22 (1H, s), 9.70 (1H, brs)
S-554	2.67 (3H, s), 3.90 (1H, dd), 4.45 (1H, dd), 4.65 (1H, dd), 7.30 (2H), 7.40-7.450 (3H), 7.60 (1H, d), 8.73 (1H, s), 8.87 (1H, d)
S-555	3.73 (1H, d), 4.47 (1H, t), 4.66 (1H, t), 4.89 (1H, t), 5.17 (1H, d), 7.10-7.46 (10H), 7.57 (1H, d), 8.79 (1H, d), 9.18 (1H, s)
S-556	1.56 (3H, d), 3.51 (1H, dd), 4.02 (1H, t), 4.95 (1H, m), 7.54 (1H, d), 8.78 (1H, d), 9.15 (1H, s), 9.32 (1H, s)
S-557	3.90 (1H, t), 4.32 (1H, t), 5.80 (1H, t), 7.38-7.46 (5H), 7.57 (1H, d), 8.81 (1H, d), 9.21 (1H, s), 9.42 (1H, brs)
S-558	3.08 (3H, s), 3.60 (1H, dd), 4.06 (1H, t), 5.78 (1H, dd), 7.28-7.40 (5H), 7.52 (1H, d), 8.74 (1H, d), 9.09 (1H, s)
S-559	3.44 (1H, dd), 3.89 (1H, t), 4.60 (1H, d), 4.73 (1H, d), 5.76 (1H, dd), 7.26-7.40 (10H), 7.53 (1H, d), 8.76 (1H, d), 9.13 (1H, s)
U-3	8.80 (1H, d), 8.66 (1H, s), 7.54 (1H, d), 4.29 (2H, t), 4.05 (2H, t), 1.18 (6H, d)
U-7	8.78 (1H, d), 8.66 (1H, s), 7.52 (1H, d), 4.28 (2H, t), 4.00 (2H, t), 1.34 (9H, s)
U-20	8.81 (1H, d), 8.67 (1H, s), 7.55 (1H, d), 7.25-7.50 (5H), 4.66 (2H, s), 4.00-4.17 (4H)

化合物	¹ H-NMR
W-194	1.45 (18H, s), 7.54 (1H, d), 7.75 (1H, d), 9.08 (1H, s), 10.17 (1H, brs)
X-35	3.24 (3H, d), 7.67 (1H, d), 8.89 (1H, s), 8.97 (1H, d), 9.24 (1H, brs), 10.32 (1H, brs)
X-43	4.90 (2H, d), 7.2-7.5 (5H, m), 7.68 (1H, d), 8.92 (1H, s), 8.98 (1H, d), 9.51 (1H, brs), 10.62 (1H, brs)
X-45	9.00 (1H, s), 8.97 (1H, d), 7.82 (1H, d), 5.04 (2H, q)
X-55	3.77 (2H, t), 4.55 (2H, t), 7.64 (1H, d), 8.84 (1H, s), 8.92 (1H, d), 9.27 (1H, brs)

进一步根据本发明的特性，在此提供一种用于控制害虫所在地的方法，所述方法包括施用有效量的式 (I) 化合物或其盐。对此，所述化合物通常以杀虫组合物形式（即，与适用于杀虫组合物中的相容稀释剂或载体和/或表面活性剂相混和）使用，例如以下文所述的形式。

下文所采用的术语“本发明化合物”包含如上所定义的式 (I) 的 3-吡啶甲酰胺和其杀虫可接受的盐。

如上所述，本发明的一个方面提供一种用于控制害虫所在地的方法。所在地包括，例如害虫自身、害虫寄居或取食的地方（植物、大田、森林、果园、水道、土壤、植物产品等）、或将易被害虫侵害的地方。因此本发明化合物可直接施用至害虫、害虫寄居或取食的地方或将易被害虫侵害的地方。

基于已有的杀虫用途，本发明提供杀虫活性化合物和利用所述化合物控制一定量的害虫种类，包括：节肢动物，尤其是昆虫或螨类或植物线虫。因此本发明的化合物可有利地用于实际应用中，例如农业或园艺作物、森林、兽药或畜牧业或公共健康中。

例如本发明化合物可用于下列施用中和下列害虫上：

控制土壤昆虫，例如南瓜十二星叶甲、白蚁（尤其用于保护建筑物）、甘蓝种蝇蛆、切根虫、根象甲、普通蛀茎夜蛾、地老虎、根蚜或蛴螬。所述化合物也可用于提供活性以控制植物致病线虫，例如根瘤线虫、孢囊线虫、桑大型针线虫、枯斑线虫、或茎线虫或甘薯茎线虫，或控制螨类。对于控制土壤害虫，例如南瓜十二星叶甲，该化合物有利地施用至或以有效量地混进土壤，其中所述土壤是种植作物

的、或将种植或播种的、或长有植物根的。

在公共健康领域，该化合物优选用于控制许多昆虫，尤其是垃圾苍蝇或其它双翅目害虫，例如家蝇、厩蝇、水虻、角蝇、鹿虻、马蝇、摇蚊、蠓、墨蚊或蚊子。

在保护储藏产品中，例如谷类，包括谷物或面粉、落花生、动物饲料、木材或家庭用品如地毯和纺织品，本发明的化合物有利地控制节肢动物，更尤其是甲虫包括象鼻虫、蛾或螨类例如粉斑螟属（粉螟）、圆皮蠹属（小圆皮蠹）、拟谷盗属（粉甲虫）、谷象属（谷类象鼻虫）或粉螨属（螨）的侵袭。

控制侵害家庭或工业房屋的蟑螂、蚂蚁或白蚁或类似节肢动物害虫，或控制水道、井、水库或其它流动或静止水中的蚊子幼虫。

以阻止建筑物中白蚁的侵袭，例如散白蚁属、异白蚁属、乳白蚁属的方式处理地基、建筑物或土壤。

在农业中控制鳞翅目（蝴蝶和蛾）的成虫、幼虫和卵，例如实夜蛾属如烟芽夜蛾、棉铃虫和 *Heliothis zea*。控制鞘翅目（甲虫）的成虫和幼虫，例如花象属如棉铃象（棉铃象甲）、*Leptinotarsa decemlineata*（马铃薯叶甲）、*Diabrotica* spp.（南瓜十二星叶甲）。控制异翅亚目（半翅目和同翅目），例如木虱属、粉虱、粉虱属、蚜属、瘤蚜属、巢菜修尾蚜、山核桃根瘤蚜属、黑尾叶蝉（rice leaf hoppers）、褐飞虱属。

控制双翅目，例如家蝇属。控制缨翅目如烟蓟马。

控制直翅目，例如飞蝗属和沙漠蝗属（蝗虫和蟋蟀）如蟋蟀属和 *Acheta* spp. 例如东方蜚蠊，美洲大蠊、德国小蠊，非洲飞蝗和沙漠蝗。控制弹尾目，例如大蠊属和小蠊属（蜚蠊）。

控制农业上重要的节肢动物，例如粉螨（螨类）例如粗脚粉螨、锐缘蜱属、纯缘蜱属、鸡皮刺螨、*Eriophyes ribis*、柑橘皱叶刺瘿螨、牛蜱属、扇头蜱属、花蜱属、璃眼蜱属、硬蜱属、瘰螨属、痒螨属、疥螨属、跗线螨属、苔螨属、全爪螨属、叶螨属、始叶螨属、爪螨属、真叶螨属。

等足目，例如 *Oniscus aselus*、*Armadium vulgare*、*Porcellio scaber*。

控制以直接或通过传播植物细菌性、病毒性、支原质体或真菌病害侵袭农业、森林或园艺上重要的植物或树木的线虫。本发明可控制的植物寄生线虫包括例如根寄生的土壤寄居线虫，例如根结线虫属（根结线虫，例如南方根结线虫、北方根结线虫和爪哇根结线虫）、异皮线虫属和球异皮线虫属（孢囊线虫，如马铃薯金线虫、苍白球异皮线虫、三叶草异皮线虫）以及穿孔线虫属，例如相似穿孔线虫、短体线虫属例如落选短体线虫、穿刺短体线虫、和弯尾短体线虫；

小垫刃线虫属例如半穿刺线虫、矮化线虫属如不定矮化线虫和克萊顿矮化线虫、盘旋线虫属例如强壮盘旋线虫、*Heliocotylenchus* 如 *Haliocotylenchus multicinctus*、刺线虫属例如长尾刺线虫、长针线虫属例如逸去长针线虫、毛刺线虫属例如原始毛刺线虫和剑线虫属如 *Xiphinema index*。

利用本发明化合物可控制的其它线虫种类是茎线虫属（茎线虫，例如起绒茎线虫和）、滑刃线虫属（叶线虫，例如菊叶茅滑刃线虫）和瘿线虫属（种子线虫例如小麦粒瘿线虫）。

在兽医或畜牧业领域、或维持公共健康控制的节肢动物中，它们是内寄生或外寄生于脊椎动物，尤其是温血脊椎动物，例如家畜如牛、羊、山羊、马、猪、家禽、狗或猫，例如蜱螨目，包括扁虱（如硬蜱属、牛蜱属如微小牛蜱、扇头蜱属如血红扇头蜱、钝缘蜱属（例如非洲钝缘蜱属）和螨类（例如畜虱属）；跳蚤；双翅目（伊蚊属、按蚊属、家蝇属、皮蝇属）；半翅目；网翅目（如大蠊属、小蠊属）；膜翅目；例如控制由植物线虫引起的消化管道侵染，例如 *Trichostrongylidae* 科的线虫。

蠕虫纲，例如血矛线虫、*Trichostrongylus*、奥斯脱线虫、古柏线虫、夏柏特线虫、圆线虫、结节线虫、猪圆线虫、钩口线虫、蛔虫和异刺线虫，以及片形吸虫。

腹足纲，例如蛞蝓属、阿勇蛞蝓属、椎实螺属、土蜗属、琥珀螺

属、双脐螺属、豆螺属、钉螺属。

双壳纲，饰贝属。

在用于控制节肢动物，尤其上昆虫或螨类，或植物线虫的实践方法中，例如包括将有效量的本发明化合物施用至植物或其生长介质。对于该方法，通常以有效量范围为约 2g 至约 1kg 的活性化合物每公顷处理场所，将本发明化合物施用至节肢动物或线虫侵袭的场所以进行控制。理想的条件下，根据所控制的害虫，更低的用量可提供足够的保护。另一方面，在不利的天气条件下，害虫的抗性或其它因素可能需要使用更高用量的活性成分。最佳用量通常取决于影响因素的多少，例如控制害虫的种类、受侵害植物的种类或生长期、行距或以及施用方法。

优选的活性化合物的施用量范围为约 10g/ha 至 400g/ha，更优选约 50g/ha 至约 200g/ha。

当害虫是土壤传播的，通常以任何常规方式，将活性化合物以配制的组合物完全均匀分布在待处理区域（即例如撒播或带状处理），并且以约 10g/ha 至约 400g ai/ha，优选约 50g/ha 至约 200 g ai/ha 的比率施用。

当以根浸（root dip）幼苗或滴灌植物施用，液剂或悬浮剂包含约 0.075 至约 1000mg ai/l，优选约 25 至约 200 mg ai/l。施用可视需要在大田或作物的常规生长区域，或接近待保护以免受侵袭的种子或植物中进行。本发明化合物可通过用水喷洒洗涤进入整个区域的土壤中，或可通过雨水的天然作用去除。施用中或施用后，配制的化合物可视需要机械地分布在土壤中，例如通过耕作、耙地或使用覆土链。施用可在种植前、种植中、种植后，但在已开始萌芽或萌芽后进行。

本发明化合物和控制所述害虫的方法在保护大田、饲料、耕地、温室、果园或葡萄园作物的装饰性或种植或森林树木特别有价值，例如：谷类（如小麦或水稻）、棉花、蔬菜（如花椒）、大田作物（如甜菜、大豆或油菜）、草地或草料作物（如玉米或高粱）、果园或树

丛（如坚果或纹孔场（pit fruit）或柑橘的）、或玻璃温室下、花园或公园中的观赏植物、花或蔬菜，或灌木或森林中、种植园中或苗圃中的林木（落叶的和常绿的）。

本发明化合物在保护木材（支撑的（standing）、采伐的、改装的、储藏的或建筑的）免受如叶蜂或甲虫或白蚁的侵袭也是颇有价值的。

无论整个、搅拌或混进产品中，本发明化合物应用于保护储藏产品如谷物、水果、坚果、香料或烟草，使其免受蛾、甲虫、螨或谷类象鼻虫的侵袭。也保护以天然或改造形式（如地毯或纺织品）的储藏动物产品例如皮肤、毛发、羊毛或羽毛，免受蛾或甲虫侵袭，以及保护储藏的肉、鱼或谷物免受甲虫、螨或苍蝇的侵袭。

此外，本发明组合物及其使用方法在控制有害的、或传播或作为家畜疾病的传播载体起作用的节肢动物或蠕虫尤其有价值，例如那些上文所提及的，并且更优选控制扁虱、螨、白虱、跳蚤、摇蚊、或叮咬、讨厌的或蝇蛆病苍蝇。本发明化合物优选用于控制存在于家畜寄主动物或取食皮肤或吸取家畜血液的节肢动物或蠕虫，对此目的该化合物应是口服的、非肠道的经皮或局部施用。

通常来说，下文所述的用于施用至生长作物或生长作物所在地或拌种的组合物可选地用于保护储藏产品、家庭用品、常规环境的特性或区域。适宜的施用本发明化合物的方法包括：以叶面喷洒（例如以犁沟喷洒）、粉剂、颗粒剂、烟雾剂或泡沫剂，或细碎的悬浮剂或胶囊化的组合物，或通过浸渍、粉剂、颗粒剂、烟剂或泡沫剂以土壤或根部处理的方式施用至生长作物；通过液浆或粉末以拌种施用至作物种子；

通过注射、口服或局部施用组合物至经节肢动物或蠕虫侵害的动物或暴露于经节肢动物或蠕虫侵害点，其中在一段时间内活性成分显示立即的和/或持续的控制节肢动物或蠕虫的作用，例如通过掺入食物或适宜的口服药物制剂、可食用的诱饵、盐砖、饮食补充物、倾泻制剂（pour-on formulation）、喷雾剂、浴液、浸液（dips）、淋浴

液 (showers)、喷射液 (jets)、粉剂、油脂、洗发剂、乳膏、蜡涂或家畜自身处理系统;

将本发明化合物以喷雾剂、弥雾剂、粉剂、烟剂、蜡涂、刷涂、颗粒剂或饵剂,或以滴入至水道、井、水库或其它流动或静止的水中的方式,施用至害虫可能潜伏的常规环境或特定位置,包括储藏产品、木材、家庭用品,或家庭或工业房屋。

式(I)化合物也可用于控制已经基因改良的作物或正在进行基因改良的作物中的有害生物。通常转基因植物以特别有利的特性而著称,例如对于某种作物保护剂的耐受性、对于植物疾病或植物疾病病原物的抵抗力,例如某种昆虫或微生物如真菌、细菌或病毒。其它特别的特性涉及例如收成物的量、品质、储藏期、组成和特定成分。因此已知的转基因植物具有提高淀粉含量或改良收成物具有不同的脂肪酸组合。

用于具经济重要性的转基因有用作物和观赏植物中是优选的,例如谷物(如小麦、大麦、裸麦、燕麦、高粱、水稻、木薯和玉米)或其它的甜菜、棉花、大豆、油菜、马铃薯、西红柿、豌豆和其它蔬菜种类的作物。

当用于转基因作物时,尤其是那些在作物中表达抗昆虫性基因的,除了在其它作物中观察到的针对有害的有机体的效用,还常出现在各转基因农作物的实施中特殊的效用。例如在实施中可以应用控制的经改良的或特别扩展的害虫谱或改变的施用量。

因此,本发明还提高式(I)化合物用于控制转基因作物中的有害有机体的用途。

另一方面,本发明提供一种包含一种或多种上述定义的本发明化合物的杀虫组合物,与之相结合的是,优选均匀分散在一种或多种相容的杀虫可接受的稀释剂或载体和/或表面活性剂[即本领域常规可接受的稀释剂或载体和/或表面活性剂类型适用于杀虫组合物并与本发明的化合物相容]。

实践中,本发明的化合物极频繁地被调配成组合物的组分。这些组

合物可用于控制节肢动物，尤其是昆虫和螨类，或蠕虫如植物线虫。所述组合物可以本领域任何已知的适宜方式，施用至室内或室外区域任何房屋的所需害虫。所述组合物包含至少一种本发明化合物作为组合物中的活性成分，或与一种或多种其它相容的成分相混合，例如固体或液体载体或稀释剂、助剂、表面活性剂等欲使用的适宜添加剂，并且是农艺学的或药学上可接受的。可以任何本领域已知的方法加以制备的该组合物同样的是本发明的一部分。

本发明的化合物，以其可商购的制剂和以该制剂所制备的使用形式，可与其它活性物质相混合，例如杀虫剂、引诱剂、杀菌剂、杀螨剂、杀线虫剂、杀真菌剂、生长调节物质或除草剂。

杀虫剂包括例如磷酸酯类、氨基甲酸酯类、羧酸酯类、甲脒类、锡化合物和微生物产生的物质：

混合物中优选的组分为

1. 来自磷化合物组

乙酰甲胺磷、甲基吡啶磷、益棉磷、保棉磷、溴硫磷、乙基溴硫磷、硫线磷（F-67825）、氯乙氧磷（Chlorethoxyphos）、毒虫畏、氯甲硫磷、毒死蜱、甲基毒死蜱、内吸磷、甲基内吸磷、砒吸磷、氯亚胺硫磷、二嗪磷、敌敌畏、百治磷、乐果、乙拌磷、苯硫磷、乙硫磷、灭线磷、乙嘧硫磷、伐灭磷、虫胺磷、杀螟硫磷、线虫磷、吡氟硫磷、倍硫磷、地虫硫磷、安果、噻唑磷、庚烯磷、氯唑磷、异拌磷、噁唑磷、马拉硫磷、虫螨畏、甲胺磷、杀扑磷、蔬果磷、速灭磷、久效磷、二溴磷、氧乐果、亚砒吸磷、对硫磷、甲基对硫磷、稻丰散、甲拌磷、伏杀硫磷、硫环磷、磷虫威（BAS-301）、亚胺硫磷、磷胺、辛硫磷、噻啉磷、乙基噻啉磷、甲基噻啉磷、丙溴磷、丙虫磷、胺丙畏、丙硫磷、吡唑硫磷、达嗪硫磷、喹硫磷、甲丙硫磷、双硫磷、特丁磷、丁基噻啉磷、杀虫畏、二甲硫吸磷、三唑磷、敌百虫、蚜灭多；

2. 来自氨基甲酸酯组

棉铃威（OK-135）、涕灭威、仲丁威（BPMC）、甲萘威、克百

威、丁硫克百威 (Carbosulfan)、除线威 (Cloethocarb)、丙硫克百威、乙硫苯威 (Ethiofencarb)、呋线威 (Furathiocarb)、HCN-801、叶蝉散、灭多威、5-甲基-间异丙苯基丁酰基(甲基)氨基甲酸甲酯 (5-methyl-m-cumenylbutyryl (methyl) carbamate)、杀线威、抗蚜威、残杀威、硫双威、久效威 (thiofanox)、1-甲硫基(亚乙基氨基)-N-甲基-N-(吗啉硫代)氨基甲酸酯 (UC 51717)、唑蚜威;

3. 来自羧酸酯组

氟酯菊酯、烯丙菊酯、顺式氯氰菊酯、(E)-(1R)-顺式-2,2-二甲基-3-(2-氧 thiolan-3-亚基甲基)环丙烷羧酸 5-苄基-3-呋喃甲酯、 β -氯氰菊酯、 α -氯氰菊酯、 β -氯氰菊酯、生物烯丙菊酯、生物烯丙菊酯((S)-环戊基异构体)、生物苄呋菊酯、氯氰菊酯、(1RS)-反式-3-(4-叔丁苯基)-2,2-二甲基环丙烷羧酸(RS)-1-氰基-1-(6-苯氧基-2-吡啶基)甲酯 (NCI 85193)、乙氰菊酯、氯氰菊酯、氯氰菊酯、氯氰戊菊酯 (Cythithrin)、氯氰菊酯、苯醚氰菊酯、溴氰菊酯、烯炔菊酯、高氰戊菊酯、五氟苯菊酯、甲氰菊酯、氰戊菊酯、氯氰戊菊酯、氯氰苯菊酯、氯胺氰菊酯 (D 异构体)、咪炔菊酯 (S-41311)、氯氰菊酯、氯菊酯、苯氧菊酯 (R) 异构体)、炔酮菊酯 (prallethrin)、除虫菊酯 (天然产物)、苄呋菊酯、七氟菊酯、胺菊酯、 θ -氯氰菊酯、四溴菊酯、反氟菊酯 (Transfluthrin)、 ξ -氯氰菊酯 (F-56701);

4. 来自脘组

双虫脘、杀虫脘;

5. 来自锡化合物组

三环锡、苯丁锡;

6. 其它

阿维菌素、ABG-9008、啉虫脘、灭螨醌、Anagrapha falcitera、AKD-1022、AKD-3059、环虫酰肼 (ANS-118)、印楝素、苏云金杆菌、Beauveria bassiana、杀虫磺、联苯肼酯、乐杀螨、BJL-932、溴螨

酯、BTG-504、BTG-505、噻嗪酮、毒杀芬、杀螟丹、乙酯杀螨醇、溴虫腈、定虫隆、2-(4-氯苯基)-4,5-二苯基噻吩(苯塞螨 UBI-T 930)、chlorfentezine、chlorproxyfen、环虫酰肼、clothianidine、2-萘甲基环丙烷羧酸酯(Ro12-0470)、灭蝇胺、噻虫嗪(diacloden)、丁醚脲、DBI-3204、2-氯-N-(3,5-二氯基-4-(1,1,2,3,3,3-六氟-1-丙氧基)苯基)氨基甲酰基)-2-甲亚胺酸乙酯、滴滴涕、三氯杀螨醇、除虫脲、N-(2,3-二氢-3-甲基-1,3-噻唑-2-亚基)-2,4-二甲苯胺、二羟甲基二羟基吡咯烷、消螨通、二硝酯、苯虫醚、埃玛菌素-苯甲酸酯、硫丹、ethiprole(sulfethiprole)、醚菊酯、乙螨唑、喹螨醚、双氧威、氟虫腈、啉蛄脲(flauazuron)、氯螨嗪(Flufenzine, SZI-121)、2-氟-5-(4-(4-乙氧苯基)-4-甲基-1-戊基)二苯醚(MTI 800)、颗粒层增殖及核型多角体病病毒(Granulosis and nuclear polyhedrosis viruses)、唑螨酯、Fenthio carb、密螨酯、氟螨嗪、flubrocyclothrinate、氟螨脲、氟虫脲、flufenzine、三氟醚菊酯、fluproxyfen、林丹、氯虫酰肼(Halfenozide)、溴氟醚菊酯(Halofenprox)、氟铃脲(DE-473)、噻螨酮、HOI-9004、伏蚁脲(AC 217300)、IKI-220、茚虫威、齐墩螨素、L-14165、吡虫啉、噁二唑虫(DPX-MP062)、Kanemite(AKD-2023)、虱螨脲、M-020、甲氧虫酰肼、弥拜菌素、NC-196、Neemgard、呋虫胺、烯啶虫胺、2-硝甲基-4,5-二氢-6H-噻嗪(DS 52618)、2-硝甲基-3,4-二氢噻唑(SD 35651)、2-硝基亚甲基-1,2-噻嗪-3-基氨基甲酸醛(噻虫醛(WL 108477))、氟酰脲、pyridaryl、炔螨特、protrifenbute、吡蚜酮、啉螨灵、密螨醚、吡丙醚、NC-196、NC-1111、NNI-9768、氟酰脲(MCW-275)、OK-9701、吡啉酯(OK-9601)、OK-9602、OK-9802、R-195、RH-0345、RH-2485、RYI-210、S-1283、S-1833、SI-8601、氟硅菊酯、Silomadine(CG-177)、多杀菌素、spirodiclofen、SU-9118、虫酰肼、吡螨胺、伏虫隆、三氯杀螨砒、杀螨硫醚、噻虫啉、杀虫环、噻虫嗪、唑虫酰胺、啉蚜威、triethoxyspinosyn A、杀虫隆、增效炔

醚、vertalec(mykotol)、YI-5301。

上述用于组合的成分是已知的活性物质，大多描述于 Ch.R Worthing, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 12th Edition, British Crop Protection Council, Farnham 2000 中。

用于本发明的化合物的有效用量可在很大范围内变化，尤其取决于待消灭的害虫种类或侵害程度，例如害虫侵害作物的程度。通常来说，本发明组合物一般包含说 0.05 至约 95%（按重量计）的一种或多种本发明的活性成分、约 1 至约 95% 的一种或多种固体或液体载体，并且任选地约 0.1 至约 50% 的一种或多种其它相容的组分，例如表面活性剂等。本说明书中，术语“载体”指有机或无机的、天然或合成的、与活性成分结合改善其施用（例如施用至植物、至种子或至土壤）的成分。因而该载体通常是惰性的并且必须是可接受的（例如农艺学可接受的，尤其对于处理植物）。

载体可为固体的，例如粘土、天然或合成硅酸盐、二氧化硅、树脂、蜡、固态肥料（例如铵盐）、地面天然矿物质（如高岭土、粘土、滑石、白垩、石英、硅镁土、蒙脱石、膨润土或硅藻土），或地面合成矿物质（如二氧化硅、氧化铝或硅酸盐，尤其是硅酸铝或硅酸镁）。如下为适用于颗粒的固体载体：碾碎的或分级的天然岩石如方解石、大理石、浮石、海泡石和白云石；无机或有机粉状的合成颗粒；有机物质颗粒如锯屑、椰子壳、玉米芯、玉米壳或烟草杆；硅藻土、磷酸三钙、粉状的软木、或吸收的碳黑；水溶性聚合物、树脂、蜡；或固体肥料。这类固体组合物可视需要含有一种或多种相容的湿润剂、分散剂、乳化剂或着色剂，当为固态时，也可用作稀释剂。

载体也可为液态，例如：水；醇类，尤其是丁醇或乙二醇，以及它们的醚或酯，优选乙酸甲基乙二酯；酮类，优选丙酮、环己酮、甲基乙基酮、甲基异丁基酮，或异佛乐酮；石油馏分如石蜡族的或芳族烃，尤其是二甲苯或烷基苯；矿物或植物油；脂肪族氯代烃，尤其是三氯乙烷或二氯甲烷；芳族氯代烃，尤其是氯苯；水溶性或强极性溶剂如二甲基甲酰胺、二甲亚砷，或 N-甲基吡咯烷酮；液化气等，或它

们的混合物。

表面活性剂可为离子或非离子类型的乳化剂、分散剂或湿润剂，或这类表面活性剂的混合物。例如聚丙烯酸盐、木质磺酸盐、苯酚磺酸或萘磺酸盐、环氧乙烷与脂肪醇或脂肪酸或脂肪酯或脂肪胺的缩聚物、取代的苯酚（尤其是烷基苯或芳基苯）、硫代琥珀酸酯的盐类、牛磺酸衍生物（尤其是烷基牛磺酸酯）、醇类或环氧乙烷与苯酚缩聚物的磷酸酯、脂肪酸与多元醇的酯、或上述化合物的硫酸酯、磺酸酯或硫酸酯官能衍生物。

当活性成分和/或惰性载体仅为水可微溶的或水不可溶，以及施用组合物的载体为水时，含有至少一种表面活性剂通常是必须的。

本发明组合物可进一步含有其它添加剂如粘合剂或着色剂。粘合剂如羧甲基纤维素，或以粉末、颗粒或网格（lattices）状形式的天然或合成聚合物，例如阿拉伯树胶、聚乙烯醇或聚乙酸乙烯酯，天然磷脂，如脑磷脂或卵磷脂，或合成磷脂可用于制剂中。可使用着色剂如无机色素，例如氧化铁、氧化钛或普鲁士蓝；有机染料如茜素染料、偶氮染料或金属酞花青染料；或微量营养物如铁盐、锰盐、硼盐、铜盐、钴盐、钼盐或锌盐。

因而，对于农业施用，本发明化合物通常以各种固体或液体形式的组合物形式。

可使用的固体组合物形式为粉剂（具有本发明化合物含量高至 80 %）、可湿性粉剂或颗粒剂（包括水分散粒剂），尤其是通过挤出、压制、浸渍颗粒载体所获得的、或从粉末初始粒化（在该可湿性粉剂或颗粒剂中，本发明化合物的含量介于约 0.5 至约 80 % 之间）。包含一种或多种本发明化合物的固体均一或不均一的组合物，例如颗粒剂、球剂、缓释剂或胶囊剂，可用于在一段时间内处理静止或流动的水。利用滴流或间歇进料上述的水分散浓缩物可获得类似效果。

液体组合物，例如包括含水的或不含水的液剂或悬浮剂（如乳油、水乳剂、漂浮剂（flowables）、分散剂或液剂）或气雾剂。液体组合物也尤其包括乳油、分散剂、水乳剂、漂浮剂、气雾剂、可湿性

粉剂（或喷粉剂）、干漂浮剂或糊剂，当施用时，组合物是液态或趋向于形成液态组合物的形式，例如用水喷雾（包括低量或超低量）或以雾剂或气雾剂。

液态组合物，例如以乳油或可溶液剂的形式大多通常含有约 5 至约 80 重量%的活性成分，然而在实例中，准备用于施用的水乳剂或液剂包含约 0.01 至约 20%的活性成分。除溶剂外，乳油或可溶液剂可视需要含有约 2 至约 50%的适当添加物，例如稳定剂、表面活性剂、渗透剂、防腐剂、着色剂或粘合剂。通过用水稀释这些浓缩物，可获得特别适合施用于例如植物的任何所需浓度的水乳剂。这些组合物包括在本发明可使用的组合物范围中。水乳剂可以油包水或水包油的形式，并且它们的密度一致。

除正常的农业施用外，本发明液体组合物可用于例如处理基质或侵害或易受节肢动物（或其它由本发明化合物控制的害虫）侵害的场所，包括房屋、室外或室内储藏或加工区域、容器或装置，或静止或流动的水。

所有这些含水的分散剂或水乳剂或喷雾混合物可通过任何适宜方法施用至，例如作物，主要通过喷雾，通常以约 100 至约 1200 升的喷雾混合物/公顷的量施用，但根据需要或施用技术可更高或更低（如低量或超低量）。本发明化合物或组合物便利地施用至植物，并且尤其是有害虫待消灭的根部或叶片。本发明化合物或组合物的另一个施用方法是通过化学灌溉（chemigation），也就是说，加入含有活性成分的制剂到灌溉水中。对于叶面杀虫剂该灌溉可洒水灌溉，或对于土壤或内吸性杀虫剂可地表灌溉或地下灌溉。

制备可用于喷雾的浓缩悬浮剂，使得产生稳定的没有结块（细磨）的液态产品，并且通常含有约 10 至约 75 重量%的活性成分、约 0.5 至约 30%的表面活性剂、约 0.1 至约 10%的触变剂、约 0 至约 30 的适合添加剂如防泡剂、防腐剂、稳定剂、渗透剂、粘合剂，以及作为载体的水或无机液体（其中活性成分微溶或不溶），一些有机或无机盐可溶解于载体中以帮助阻止沉淀或用作水的防冻剂。

通常制备的可湿性粉剂（或喷粉剂）含有约 10 至约 80 重量%的活性成分、约 20 至约 90%的固体载体、约 0 至约 5%的湿润剂、约 3 至约 10 的分散剂，并且视需要含有约 0 至 80%的一种或多种稳定剂和/或其它添加剂如渗透剂、粘合剂、抗结块剂、着色剂等。为得到该可湿性粉剂，在适宜的搅拌机中，活性成分与添加物质完全混合，这可注入多孔填充物上并用磨机或其它适合的研磨工具研磨。这样所得到的可湿性粉剂的润湿性和悬浮性是有利的。它们可悬浮在水中以获得任何所需的浓度，并且使用该悬浮剂非常有利，尤其施用至植物叶片。

“水分散粒剂（WG）”（容易分散在水中的颗粒）是完全接近于可湿性粉剂的组合物。可通过将上述可湿性粉剂颗粒化、或通过湿法（将细碎的活性物质与惰性填充物和微量水，如 1 至 20 重量%，或与分散剂的水溶液或粘合剂相接触，随后干燥并过筛）、或通过干法（磨碎并过筛后压制）来加以制备。

配制的组合物的量和浓度可根据施用方法或组合物性质或其使用有所不同。通常来说，用于控制节肢动物或蠕虫害虫的组合物含有约 0.00001 重量%至约 95 重量%，更优选约 0.0005 重量%至约 50 重量%的一种或多种本发明化合物，或总的活性成分（即本发明化合物与其它对节肢动物或蠕虫有毒的物质、增效剂、微量元素或稳定剂的总量）。将由农场主、养畜者、开业医生或开业兽医、害虫控制者或其它本领域技术人员对实际使用的组合物和施用量进行选择，以达到所需效果。主要施用于动物、木材、储藏产品或家庭用品的固体或液体组合物通常含有约 0.00005 重量%至约 90 重量%，更优选约 0.001 重量%至约 10 重量%的一种或多种本发明化合物。对于口服或非肠道管理动物，包括经皮固体或液体组合物，它们通常含有约 0.1 重量%至约 90 重量%的一种或多种本发明化合物。

加药饲料通常含有约 0.001 重量%至约 3 重量%的一种或多种本发明化合物。与饲料混合的浓度或添加物通常含有约 5 重量%至约 90 重量%，优选约 5 重量%至约 50 重量%的一种或多种本发明化合物。

天然盐品 (mineral salt licks) 通常含有约 0.1 重量%至约 10 重量%的一种或多种式 (I) 化合物或其杀虫可接受的盐。

施用至家畜、货物、房屋或室外区域的粉剂或液体化合物可含有约 0.0001 重量%至约 15 重量%，更优选约 0.005 重量%至约 2.0 重量%的一种或多种本发明化合物。

处理水中适宜的浓度介于约 0.0001ppm 和约 20ppm 之间，更优选约 0.001ppm 至约 5.0ppm 的一种或多种本发明化合物，并且采用适当的曝露持续时间可治疗性用于鱼类养殖中。可食用的诱饵可含有约 0.01 重量%至约 5 重量%，优选约 0.01 重量%至约 1.0 重量%的一种或多种本发明化合物。

当非肠道地处理脊椎动物时，以经口或经皮或其它方法，本发明化合物的剂量将取决于脊椎动物的种类、龄期或健康状态，并且取决于由节肢动物或蠕虫害虫的种类和其作用的程度或潜在的侵害。对于持续的药物，通过口服或肠胃外投药，处理一次剂量约 0.1 至 100mg，优选约 2.0 至约 20.0mg/kg 的动物体重，或每天每 kg 的动物体重的剂量为约 0.01 至约 20.0mg，优选约 0.1 至约 5.0mg 通常是优选的。通过利用持续释放制剂或装置，几个月内每天所需剂量可由一次处理一起并且投药给动物。

下面的组合物实施例 2A-2M 说明用于控制节肢动物，尤其是昆虫或螨类，或蠕虫如植物线虫的组合物，其包含作为活性成分的本发明化合物，如制备实施例中所述的化合物。描述于实施例 2A-2M 中的组合物均可稀释，以获得用于大田中的适宜浓度的可喷洒组合物。用于下列组合物实施例 2A-2M 中的成分的一般化学描述（下列所有百分比以重量百分比）如下所示：

商品名	化学描述
Ethylan BCP	壬基酚环氧乙烷浓缩物
Soprophor BSU	三苯乙烯基苯酚环氧乙烷浓缩物
Arylan CA	70% w/v 的十二烷基苯磺酸钙
Solvesso 150	Light C ₁₀ 芳族溶剂

Arylan S	十二烷基苯磺酸钠
Darvan NO ₂	木质素磺酸钠
Celite PF	合成硅酸镁载体
Sopropo T36	聚羧酸钠盐
Rhodigel 23	多糖黄原胶
Bentone 38	镁蒙脱石的有机衍生物
Aerosil	细微的二氧化硅

实施例 2A

用如下组分制备水溶性浓缩物:

活性成分	7 %
Ethylan BCP	10 %
N-甲基吡咯烷酮	83 %

伴随着加热和搅拌, 向溶解于部分 N-甲基吡咯烷酮的 Ethylan BCP 溶液加入活性成分, 直至溶解。所得溶液用剩余溶剂定容。

实施例 2B

用如下组分制备乳油 (EC):

活性成分	25 % (最大)
Soprophor BSU	10 %
Arylan CA	5 %
N-甲基吡咯烷酮	50 %
Solvesso 150	10 %

将前面三个组分溶于 N-甲基吡咯烷酮中, 然后将 Solvesso 150 加至其中, 得到最终体积。

实施例 2C

用如下组分制备可湿性粉剂 (WP):

活性成分	40 %
Arylan S	2 %

Darvan NO ₂	5 %
------------------------	-----

Celite PF	53 %
-----------	------

将上述成分混合并在锤磨机中研磨至低于 50 微米颗粒大小的粉末。

实施例 2D

用如下组分制备水悬浮剂:

活性成分	40.00 %
Ethylan BCP	1.00 %
Sopropon T360.	0.20 %
乙二醇	5.00 %
Rhodigel 230.	0.15 %
水	53.65 %

将上述成分充分混合并且在球磨机中研磨,直到所获得的平均粒度低于 3 微米。

实施例 2E

用如下组分制备可乳化的悬浮剂:

活性成分	30.0 %
Ethylan BCP	10.0 %
Bentone 38	0.5 %
Solvesso 150	59.5 %

将上述成分充分混合并在球磨机中研磨,直到所获得的平均粒度低于 3 微米。

实施例 2F

用如下组分制备水分散粒剂:

活性成分	30 %
Darvan No 2	15 %
Arylan S	8 %
Celite PF	47 %

将上述成分混合,在喷射式磨机中微粉化,并且随后在旋转造粒机中通过用水喷雾粒化(高至 10 %)。所得颗粒在流化床干燥器上干燥以除去多余的水。

实施例 2G

用如下组分制备粉剂：

活性成分	1 至 10 %
超细滑石粉末	99 至 90 %

将上述成分充分混合并且视需要进一步研磨以获得更细的粉末。该粉末可用于节肢动物侵害场所，例如垃圾场、储藏产品或家庭用品，或由节肢动物所侵害的或处于侵害危险的动物，以通过口服控制节肢动物。用于将粉剂分布于节肢动物侵害的场所的适宜方法包括机械鼓风、手摇抖动器或家畜自身处理装置。

实施例 2H

用如下组分制备可食用饵剂：

活性成分	0.1 至 1.0 %
小麦面粉	80 %
糖浆	19.9 至 19 %

将上述成分充分混合并且制成所需的饵剂形式。该可食用的饵剂可分布于受到节肢动物（例如蚂蚁、蝗虫、蟑螂或苍蝇）侵害的某一场所，例如家庭或工业房屋，如厨房、医院或储藏室、或室外区域，以通过口服控制节肢动物。

实施例 2I

用如下组分制备液剂：

活性成分	15 %
二甲亚砜	85 %

将活性成分搅拌溶解在二甲亚砜中，并视需要加热。该溶液可以注入施用（pour-on application）的方式经皮施用至被节肢动物侵害的家畜，或经过滤杀菌后通过聚四氟乙烯膜（0.22 微米的孔径），通过非肠道注射，以施用量为 1.2 至 12ml 溶液/100kg 动物体重。

实施例 2J

用如下组分制备可湿性粉剂：

活性成分	50 %
Ethylan BCP	5 %
Aerosil	5 %
Celite PF	40 %

将 Ethylan BCP 吸附在 Aerosil 上，随后用其它成分混合并在锤磨机中研磨以得到可湿性粉剂，该可湿性粉剂可用水稀释至浓度为 0.001 % 至 2 重量 % 的活性化合物，并且通过喷雾施用至被节肢动物（例如双翅类幼虫或植物线虫）侵害的场所，或通过喷雾或浸涂、或通过在水给药施用至由节肢动物侵害的或处于侵害危险的家畜，以控制节肢动物。

实施例 2K

由颗粒剂形成的缓释丸剂根据需要含有不同百分比的下列组分（类似于如前所述的组合物）：

活性成分
增稠剂
缓释剂
粘合剂

将充分混合的上述组分成形加工成颗粒，该颗粒压制成比重为 2 或更高的丸剂。该丸剂可以滞留在网状瘤胃中的方式口服给药至反刍家畜，使得在长时间内连续缓慢释放活性化合物，以控制由节肢动物对反刍家畜的侵害。

实施例 2L

以颗粒剂、球剂、块剂等形式的缓释组合物可由下列组分制得：

活性成分	0.5 至 25 %
聚氯乙烯	75 至 99.5 %

二辛基邻苯二甲酸至酯（增塑剂）

将上述组分混合并且随后通过熔体挤出或模塑法形成适宜的形状。例如该组合物用于加入静止水或装入与家畜相连的颈圈或耳标，通过缓慢释放控制害虫。

实施例 2M

用如下组分制备水分散粒剂：

活性成分	85 %（最大）
聚乙烯吡咯烷酮	5 %
硅镁土	6 %
十二烷基硫酸钠	2 %
甘油	2 %

将上述组分用水混合成 45 % 的浆料，并且湿磨成颗粒大小为 4 微米，随后喷雾干燥除去水。

杀虫应用方法

利用本发明化合物进行下面典型的试验方法，以测定本发明化合物的杀蠕虫和杀虫活性。

方法 A:

将具有种子根的发芽蚕豆种子（*Vicia faba*）移至装有自来水的棕色玻璃瓶中，随后使大约 100 只豆蚜（豆卫矛蚜）覆于其上。然后将植物和蚜虫浸入待测定的调配制剂的水溶液中 5 秒钟。待溶液滴尽后，将植物和蚜虫放置于环境控制箱中（每天光照 16 小时、25℃、40-60%的相对湿度）。待放置 3 和 6 天后，测定制剂对蚜虫的效果。在 100ppm 的浓度下（以活性物质的含量为基准），下列化合物引起至少 50 % 的蚜虫致死率：

A-18, A-64, A-65, A-71, A-74, A-79, A-81, A-86, A-88, A-206, A-209, A-223, A-255, A-261, A-262, A-265, A-267, A-268, A-292, A-296, A-312, A-312, A-316, A-317, A-326, A-329, A-349,

A-353, A-354, A-355, A-365, A-366, A-367, A-369, A-373, A-381, A-398, A-431, A-524, A-529, A-540, A-544, A-564, A-605, A-626, A-691, A-697, A-713, A-736, A-737, A-738, A-744, A-745, A-747, A-748, A-798, A-799, A-805, A-822, A-861, A-862, A-865, A-867, A-874, B-37, B-40, B-47, B-65, B-74, B-149, B-150, B-151, B-152, B-155, B-158, B-163, B-166, B-167, B-168, B-169, B-170, B-176, B-184, B-185, B-189, B-247, B-251, B-255, B-258, B-259, B-261, B-267, B-269, B-296, B-313, B-349, B-353, B-354, B-355, B-366, B-369, B-373, B-398, B-431, B-564, B-713, B-736, B-737, B-738, B-744, B-745, B-747, B-748, B-799, B-805, B-822, B-861, B-863, B-864, B-865, B-867, B-869, B-870, B-871, B-873, B-874, B-877, C-85, E-85, F-85, F-88, H-85, S-548, S-550, S-551, S-552, S-553, S-555, S-556, S-558, S-559, U-3, U-7, U-20, X-45 和 X-55。

方法 B:

将具种子根的发芽蚕豆种子 (*Vicia faba*) 移至装有自来水的棕色玻璃瓶中, 吸入 4 毫升待测定调配制剂的水溶液至棕色玻璃瓶中。随后使大约 100 只豆蚜 (豆卫矛蚜) 完全覆于其上。将植物和蚜虫放置于环境控制箱中 (每天光照 16 小时、25℃、40-60%的相对湿度)。待放置 3 和 6 天后, 测定制剂对蚜虫的根系效果。在 10ppm 的浓度下 (以活性物质的含量为基准), 通过根系作用, 下列化合物引起至少 80% 的蚜虫致死率:

A-39, A-64, A-65, A-67, A-71, A-74, A-79, A-81, A-86, A-88, A-89, A-90, A-209, A-212, A-223, A-262, A-265, A-267, A-268, A-292, A-296, A-313, A-317, A-326, A-329, A-349, A-354, A-355, A-365, A-366, A-367, A-369, A-373, A-381, A-398, A-431, A-519, A-524, A-529, A-540, A-544, A-564, A-605, A-626, A-691, A-697, A-713, A-736, A-737, A-738, A-744, A-745, A-747, A-748, A-798,

A-799, A-805, A-822, A-861, A-862, A-865, A-867, A-871, A-873, A-874, B-37, B-40, B-47, B-65, B-71, B-74, B-86, B-149, B-150, B-151, B-152, B-155, B-158, B-166, B-167, B-169, B-170, B-176, B-184, B-189, B-247, B-251, B-255, B-257, B-258, B-259, B-261, B-267, B-269, B-296, B-313, B-349, B-353, B-354, B-355, B-366, B-369, B-373, B-398, B-564, B-713, B-736, B-737, B-738, B-744, B-745, B-748, B-799, B-805, B-861, B-863, B-864, B-865, B-867, B-869, B-870, B-871, B-872, B-873, B-874, B-877, C-85, D-86, E-85, F-85, F-88, G-85, H-85, S-3, S-120, S-356, S-548, S-550, S-551, S-553, S-556, S-557, S-558, S-559, U-3, U-7, U-20, X-45 和 X-55。