



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公告本

(11)證書號數：TW I498082 B

(45)公告日：中華民國 104 (2015) 年 09 月 01 日

(21)申請案號：100121941

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 06 月 23 日

(51)Int. Cl. : A01N33/00 (2006.01)

A01N43/00 (2006.01)

(30)優先權：2010/06/24 日本

2010-143577

(71)申請人：組合化學工業股份有限公司 (日本) KUMIAI CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.
(JP)

日本

庵原化學工業股份有限公司 (日本) IHARA CHEMICAL INDUSTRY CO., LTD.

(JP)

日本

(72)發明人：福本俊一郎 FUKUMOTO, SHUNICHIROU (JP)；志鎌大介 SHIKAMA, DAISUKE
(JP)；鳥谷部啟二 TORIYABE, KEIJI (JP)；永田俊浩 NAGATA, TOSHIHIRO
(JP)；小松正明 KOMATSU, MASAOKI (JP)；松田武 MATSUDA, TAKESHI
(JP)；中野勇樹 NAKANO, YUKI (JP)

(74)代理人：洪澄文

(56)參考文獻：

CN 1200117A

審查人員：陳成寶

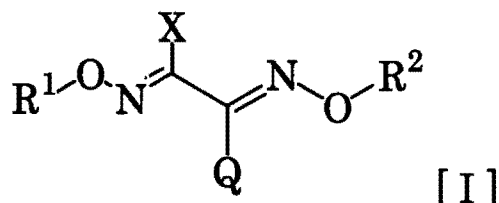
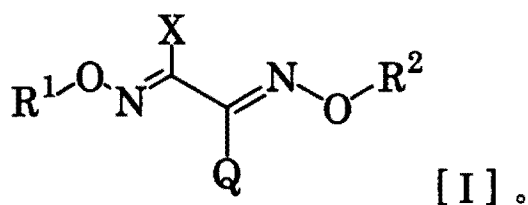
申請專利範圍項數：8 項 圖式數：0 共 230 頁

(54)名稱

烷氧亞胺衍生物及有害生物防除劑

(57)摘要

本發明提供新穎的烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許的鹽，及含有該衍生物或鹽當做有效成分且對於農園藝領域的廣範圍的有害生物顯示優異的防除效果，同時對於有抗藥性的有害生物也能防除的有害生物防除劑。本發明之新穎烷氧亞胺衍生物，其特徵為以通式[I]表示，且本發明之有害生物防除劑的特徵為含有上述本發明烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽當做有效成分：

[式中，X、R¹、R²、Q 如說明書中所定義]。

公告本

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：100121941

※申請日：100.6.23

※IPC 分類：

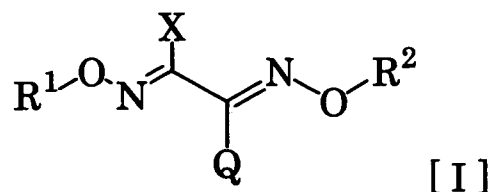
A01N 33/00 (2006.01)
A01N 43/00 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

烷氧亞胺衍生物及有害生物防除劑

二、中文發明摘要：

本發明提供新穎的烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許的鹽，及含有該衍生物或鹽當做有效成分且對於農園藝領域的廣範圍的有害生物顯示優異的防除效果，同時對於有抗藥性的有害生物也能防除的有害生物防除劑。本發明之新穎烷氧亞胺衍生物，其特徵為以通式[I]表示，且本發明之有害生物防除劑的特徵為含有上述本發明烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽當做有效成分：



[式中，X、R¹、R²、Q如說明書中所定義]。

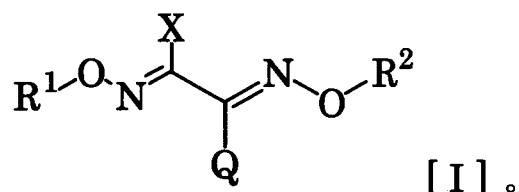
三、英文發明摘要：

四、指定代表圖：

(一) 本案指定代表圖為：無。

(二) 本代表圖之元件符號簡單說明：無。

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於新穎的烷氧亞胺衍生物或其鹽，及含有該衍生物或其鹽當做有效成分的有害生物防除劑。

【先前技術】

以往，就關於與本發明之烷氧亞胺衍生物類似之化合物的文獻，已知例如以下的專利文獻 1 或專利文獻 2。

專利文獻 1 中揭示羥肟醯基(hydroximoyl)唑衍生物，但是係限定於具有胺基甲酸酯構造之化合物，並未揭示本發明之烷氧亞胺衍生物。

專利文獻 2 中揭示羥肟醯基(hydroximoyl)衍生物，但是係限定於 O-醯基衍生物，並未揭示本發明之烷氧亞胺衍生物。

【先前技術文獻】

【專利文獻】

【專利文獻 1】 DE-3150984 號公報

【專利文獻 2】 日本特開平 7-41704 號公報

【發明內容】**【發明欲解決之課題】**

對於有用作物使用的殺蟲劑或殺蟎劑等有害生物防除劑，希望是對於人畜為安全，且對於環境的影響少，對於有害生物能以低藥量即顯示充分效果的藥劑。又，由於長年使用殺蟲劑或殺蟎劑，已逐漸出現獲得抗藥性的有害生物，因此習知的藥劑變得難以完全防除有害生物。

本發明之課題在於提供解決習知之有害生物防除劑具有之前述問題的優異的有害生物防除劑。

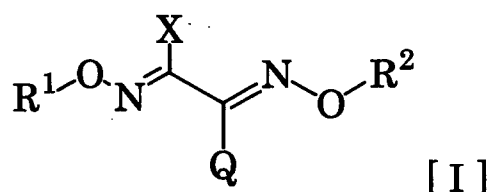
【解決課題之方式】

本案發明人等，為了開發具有前述良好特性的有害生物防除劑，合成各種烷氧亞胺衍生物並針對其生理活性進行探討。結果發現：以下列通式[I]表示之烷氧亞胺衍生物，對於有害生物及獲得抗藥性的有害生物顯示高度效果，乃完成本發明。

亦即，本發明以下列特徵為要旨。

(1) 一種烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽，其特徵為以通式[I]表示：

通式[I]



[式 中 ,

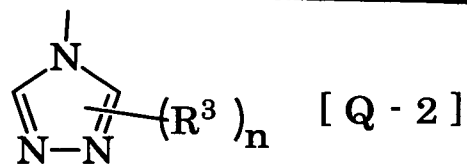
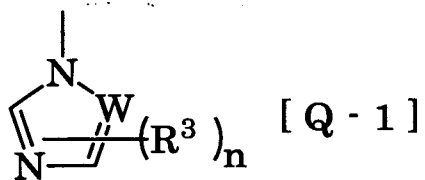
X 代表 氫 原子、鹵 素 原 子、氰 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ 烷 基、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ 烯 基、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ 炔 基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ 環 烷 基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ 環 烷 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 鹵 烷 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 硫 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基 亞 磺 醯 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基 磺 醯 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 硫 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基 亞 磺 醯 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基 磺 醯 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 氧 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 氧 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、硫 代 胺 甲 醯 基、 $\text{R}^4\text{R}^5\text{NC}(=\text{O})$ 基、 $\text{R}^6\text{R}^7\text{N}$ 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 氧 基 羰 基、羧 基、 $\text{R}^8\text{O}(\text{HN}=\text{O})\text{C}$ 基、 $\text{R}^9\text{ON}=(\text{R}^{10})\text{C}$ 基、 $\text{R}^{11}\text{S}(\text{O}=\text{O})\text{C}$ 基、 $\text{R}^{12}\text{R}^{13}\text{NSO}_2\text{NH}$ 基、羥 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、氰 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基 羰 基、可 經 選 自 取 代 基 群 α 之 取 代 基 取 代 之 苯 基 或 具 有 可 為 相 同 或 相 異 之 選 自 氧 原 子、硫 原 子 及 氮 原 子 當 中 1 至 5 個 雜 原 子 的 碳 數 1 至 9 的 雜 環 基 (該 基 也 可 經 1~5 個 鹵 素 原 子、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 鹵 烷 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 氧 基、側 氧 基 或 氰 基 取 代) ,

R^1 代 表 $\text{C}_1\sim\text{C}_{10}$ 烷 基、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ 烯 基、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ 炔 基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ 環 烷 基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ 環 烷 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 鹵 烷 基、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ 鹵 烯 基、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ 鹵 炔 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 硫 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基 亞 磺 醯 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基 磺 醯 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 氧 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 鹵 烷 氧 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 氧 基 亞 胺 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、三 ($\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基) 甲 矽 烷 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、氰 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、gem-二 ($\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 氧 基) $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、羥 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷 基、胺 基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$

烷基(該基也可經 R^{14} 、 R^{15} 取代)、也可經選自取代基群 α 當中的取代基取代之苯基、也可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基 $C_1\sim C_6$ 烷基、也可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基 $C_2\sim C_6$ 烯基、也可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯氧基 $C_1\sim C_6$ 烷基、具有可相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中 1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環基(該基也可經 1~5 個鹵素原子、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基或氰基取代)、以具有可為相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中 1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環取代之 $C_1\sim C_6$ 烷基(該基也可經 1~5 個鹵素原子、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基、側氧基或氰基取代)或經具有可相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中 1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環取代之 $C_2\sim C_6$ 烯基(該基也可經 1~5 個鹵素原子、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基或氰基取代),

前述雜環基含有氮原子時,也可經氧化而成為 N-氧化物, R^2 代表 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_2\sim C_6$ 烯基、 $C_2\sim C_6$ 炔基、 $C_3\sim C_6$ 環烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_2\sim C_6$ 鹵烯基、 $C_2\sim C_6$ 鹵炔基、 $C_1\sim C_6$ 烷硫基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷基亞磺基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷基磺基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷氧基 $C_1\sim C_6$ 烷基、氰基 $C_1\sim C_6$ 烷基或也可經取代基群 α 取代之苯基 $C_1\sim C_6$ 烷基,

Q 代表以式 [Q-1] 或式 [Q-2] 表示之雜環基或鹵素原子,



式 [Q-1] 中，W 代表氮原子或亞甲基，

以式 [Q-1] 及式 [Q-2] 表示之雜環基之氮原子也可經氧化成 N-氧化物，

式 [Q-1] 及式 [Q-2] 中， R^3 代表鹵素原子、氰基、硝基、羥基、巰基、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基、 $C_1\sim C_6$ 烷硫基、 $C_1\sim C_6$ 烷基亞磺醯基、 $C_1\sim C_6$ 烷基磺醯基、甲醯基或羥基亞胺基 $C_1\sim C_4$ 烷基，

式 [Q-1] 中，n 於 W 為氮原子時，代表 0、1 或 2，於 W 為亞甲基時，代表 0、1、2 或 3，

R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 及 R^{15} ，各自代表氫原子、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷基羰基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_3\sim C_6$ 環烷基、 $C_3\sim C_6$ 環烷基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷基磺醯基或氰基 $C_1\sim C_6$ 烷基或也可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基，

又， R^4 與 R^5 、 R^6 與 R^7 、 R^{12} 與 R^{13} 及 R^{14} 與 R^{15} ，也可藉由各自成為一體而形成 $C_2\sim C_7$ 伸烷基鏈並與鍵結的氮原子一起形成 3~8 員環，該伸烷基鏈也可含有 1 個氧原子、硫原子或氮原子，再者，該伸烷基鏈也可經鹵素原子、 $C_1\sim C_6$ 烷基、側氧基取代，

R^8 及 R^9 各自代表氫原子、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基或 $C_1\sim C_6$ 烷氧基羰基，

R^{10} 代表 R^6R^7N 基或 Q，

R^{11} 代表 $C_1 \sim C_6$ 烷基]

「取代基群 α 」

鹵素原子、 $C_1 \sim C_6$ 烷基、 $C_1 \sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基、 $C_1 \sim C_6$ 鹵烷氧基、 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基羰基、硝基及氰基。

(2) 如(1)之烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽，其中 X 代表氫原子、鹵素原子、氰基、 $C_1 \sim C_8$ 烷基、 $C_3 \sim C_6$ 環烷基、 $C_1 \sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1 \sim C_6$ 烷硫基、 $C_1 \sim C_6$ 烷基亞磺醯基、 $C_1 \sim C_6$ 烷基磺醯基、 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基、硫代胺甲醯基、 $R^4 R^5 NC(=O)$ 基、 $R^6 R^7 N$ 基、 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基羰基、羧基、 $R^8 O(HN=)C$ 基、 $R^9 ON=(R^{10})C$ 基、 $R^{11} S(O=)C$ 基、 $R^{12} R^{13} NSO_2 NH$ 基、羥基 $C_1 \sim C_6$ 烷基、氰基 $C_1 \sim C_6$ 烷基、 $C_1 \sim C_6$ 烷基羰基、也可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基或具有可為相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中 1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環基(該基也可經 1~5 個鹵素原子、 $C_1 \sim C_6$ 烷基、 $C_1 \sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基、側氧基或氰基取代)，

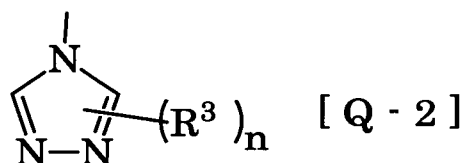
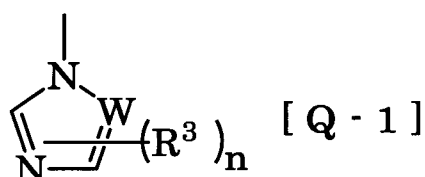
R^1 代表 $C_1 \sim C_{10}$ 烷基、 $C_2 \sim C_6$ 烯基、 $C_2 \sim C_6$ 炔基、 $C_3 \sim C_6$ 環烷基、 $C_3 \sim C_6$ 環烷基 $C_1 \sim C_6$ 烷基、 $C_1 \sim C_6$ 鹵烷基、 $C_2 \sim C_6$ 鹵烯基、 $C_1 \sim C_6$ 烷硫基 $C_1 \sim C_6$ 烷基、 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基 $C_1 \sim C_6$ 烷基、 $C_1 \sim C_6$ 鹵烷氧基 $C_1 \sim C_6$ 烷基、三($C_1 \sim C_6$ 烷基)甲矽烷基 $C_1 \sim C_6$ 烷基、氰基 $C_1 \sim C_6$ 烷基、gem-二($C_1 \sim C_6$ 烷氧基) $C_1 \sim C_6$ 烷基、羥基 $C_1 \sim C_6$ 烷基、胺基 $C_1 \sim C_6$ 烷基(該基也可經 R^{14} 或 R^{15} 取代)、也可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基、也可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基 $C_1 \sim C_6$ 烷基、也可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基 $C_2 \sim C_6$ 烯基、也可

經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯氧基 $C_1\sim C_6$ 烷基、具有可相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中 1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環基(該基也可經 1~5 個鹵素原子、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基或氰基取代)或經具有可相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中 1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環取代之 $C_1\sim C_6$ 烷基(該基也可經 1~5 個鹵素原子、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基、側氧基或氰基取代)，

前述雜環基含有氮原子時，也可經氧化成 N-氧化物，

R^2 代表 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_2\sim C_6$ 烯基、 $C_2\sim C_6$ 炔基、 $C_3\sim C_6$ 環烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基 $C_1\sim C_6$ 烷基、氰基 $C_1\sim C_6$ 烷基或也可經取代基群 α 取代之苯基 $C_1\sim C_6$ 烷基，

Q 為以式 [Q-1] 或式 [Q-2] 表示之雜環基或鹵素原子，



式 [Q-1] 中，W 為氮原子或亞甲基，

式 [Q-1] 及式 [Q-2] 中， R^3 為巯基或 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基，

式 [Q-1] 及式 [Q-2] 中，n 為 0 或 1，

R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 及 R^{15} 各自為氫原子、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基、 $C_1\sim C_6$ 烷基羰基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_3\sim C_6$ 環烷基 $C_1\sim C_6$ 烷基、氰基 $C_1\sim C_6$ 烷基或也可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基，

又， R^4 與 R^5 、 R^6 與 R^7 、 R^{12} 與 R^{13} 及 R^{14} 與 R^{15} ，也可藉由

各自成為一體而形成 $C_2 \sim C_7$ 伸烷基鏈並與鍵結之氮原子一起形成 3~8 員環，該伸烷基鏈也可含有 1 個氧原子、硫原子或氮原子，

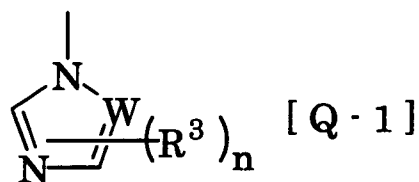
R^8 及 R^9 ，各自為氫原子、 $C_1 \sim C_6$ 烷基或 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基羰基，

R^{10} 為 $R^6 R^7 N$ 基或 Q ，

R^{11} 為 $C_1 \sim C_6$ 烷基。

(3) 如(1)或(2)之烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽，其中 Q 為鹵素原子。

(4) 如(1)或(2)之烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽，其中 Q 為以式 [Q-1] 表示之雜環基：



。

(5) 一種有害生物防除劑，其特徵為含有前述(1)至(4)中任一項記載之烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽當做有效成分。

(6) 如(5)之有害生物防除劑，其係殺蟲劑。

(7) 一種有害生物之防除方法，其特徵為：使用有效成分量的如前述(1)至(4)中任一項之烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽。

(8) 如(7)之有害生物之防除方法，其係使用烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽當做殺蟲劑。

【發明之效果】

本發明之烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽，為新穎化合物，而且含有此等當做有效成分之有害生物防除劑，對於農園藝領域中的廣範圍的有害生物顯示優異的防除效果，且也能防除帶有抗藥性的有害生物，尤其對於以褐飛蝨、姬飛浮塵子、白背飛蝨、黑尾浮塵子、棉蚜、煙草粉蝨等為代表的半翅目害蟲顯示卓越效果。

【實施方式】

【實施發明之最佳形態】

以下說明本說明書記載之記號及用語。

本發明中，有害生物防除劑係指對於農園藝領域或畜產・衛生領域等中的有害節肢動物為對象的害蟲防除劑（農園藝用殺蟲・殺蟎劑、家畜或當做玩賞動物的哺乳動物及鳥類的內部或外部寄生蟲防除劑、家庭用及業務用衛生害蟲或不快害蟲驅除劑）。

又，本發明中，農藥係指於農園藝領域的殺蟲・殺蟎劑、殺線蟲劑等。

鹵素原子代表氟原子、氯原子、溴原子或碘原子。

C₁~C₆烷基，如無特別限定，則代表碳數1~6之直鏈或分支鏈狀之烷基，例如甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、第二丁基、異丁基、第三丁基、正戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、異戊基、1-乙基丙基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、新戊基、正己基、1-甲基戊基、2-甲基

戊基、3-甲基戊基、異己基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基或 1-乙基-1-甲基丙基等基。

$C_1 \sim C_8$ 烷基，如無特別限定，則代表碳數為 1~8 之直鏈或分支鏈狀之烷基，例如前述 $C_1 \sim C_6$ 烷基的例示，此外例如正庚基、1-甲基己基、5-甲基己基、4,4-二甲基戊基、正辛基、1-甲基庚基、6-甲基庚基或 5,5-二甲基己基等基。

$C_1 \sim C_{10}$ 烷基，如無特別限定，則代表碳數 1~10 之直鏈或分支鏈狀之烷基，例如前述 $C_1 \sim C_8$ 烷基中的例示，此外例如正壬基、異壬基、正癸基、異癸基、7,7-二甲基辛基或正十一基等基。

$C_2 \sim C_6$ 烯基，如無特別限定，則指碳數 2~6 之直鏈或分支鏈狀之烯基，例如乙烯基、1-丙烯基、異丙烯基、2-丙烯基、1-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-丁烯基、1-甲基-2-丙烯基、3-丁烯基、2-甲基-1-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1,3-丁二烯基、1-戊烯基、1-乙基-2-丙烯基、2-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、3-戊烯基、1-甲基-2-丁烯基、4-戊烯基、1-甲基-3-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,3-戊二烯基、1-乙烯基-2-丙烯基、1-己烯基、1-丙基-2-丙烯基、2-己烯基、1-甲基-1-戊烯

基、1-乙基-2-丁烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-4-戊烯基、1-乙基-3-丁烯基、1-(異丁基)乙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-2-丙烯基、1-(異丙基)-2-丙烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1,5-己二烯基、1-乙基-3-丁烯基或2,4-己二烯基等基。

$C_2 \sim C_6$ 炔基，如無特別限定，則指碳數 2~6 之直鏈或分支鏈狀之炔基，例如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-戊炔基、1-乙基-2-丙炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、4-戊炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、1-己炔基、1-(正丙基)-2-丙炔基、2-己炔基、1-乙基-2-丁炔基、3-己炔基、1-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、4-甲基-1-戊炔基、3-甲基-1-戊炔基、5-己炔基、1-乙基-3-丁炔基、1-乙基-1-甲基-2-丙炔基、1-(異丙基)-2-丙炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基或2,2-二甲基-3-丁炔基等基。

$C_3 \sim C_6$ 環烷基，如無特別限定，則指碳數 3~6 之環烷基，例如環丙基、環丁基、環戊基或環己基等基。

$C_3 \sim C_6$ 環烷基 $C_1 \sim C_6$ 烷基，如無特別限定，則環烷基部分及烷基部分代表上述含意即($C_3 \sim C_6$ 環烷基)-($C_1 \sim C_6$ 烷基)基，例如環丙基甲基、環丁基甲基、環戊基甲基或環己基

甲基等基。

$C_1 \sim C_6$ 烷氧基，如無特別限定，則烷基部分代表上述含意即 ($C_1 \sim C_6$ 烷基)-O-基，例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、異丁氧基、第三丁氧基、戊氧基、異戊氧基、己氧基或異己氧基等基。

$C_1 \sim C_6$ 鹵烷基，如無特別限定，則代表以相同或相異之 1~13 個鹵素原子、較佳為 1~5 個鹵素原子取代之碳數 1~6 之直鏈或分支鏈狀之烷基，例如 2-氟乙基、2, 2, 2-三氟乙基、3, 3, 3-三氟丙基或 2, 2, 2-三氯乙基等基。

$C_2 \sim C_6$ 鹵烯基，如無特別限定，則代表以相同或不同之 1~11 個鹵素原子，較佳為 1~5 個取代的碳數 2~6 之直鏈或分支鏈烯基，例如 3-氯-2-丙烯基、2-氯-2-丙烯基、3, 3-二氯-2-丙烯基或 4, 4-二氯-3-丁烯基等基。

$C_2 \sim C_6$ 鹵炔基，如無特別限定，則代表以相同或不同之 1~4 個鹵素原子取代之碳數 2~6 之直鏈或分支鏈炔基，例如：3-氯-2-丙炔基、3-溴-2-丙炔基、3-碘-2-丙炔基、3-氯-1-丙炔基、5-氯-4-戊炔基等基。

$C_1 \sim C_6$ 鹵烷氧基，如無特別限定，則代表鹵烷基部分具有前述含意之以相同或相異之 1~11 個鹵素原子，較佳為 1~5 個鹵素原子取代的碳數 1~6 之直鏈或分支鏈之烷基-O-基，例如氯甲氧基、二氟甲氧基、氯二氟甲氧基、三氟甲氧基或 2, 2, 2-三氯乙氧基等基。

$C_1 \sim C_6$ 烷硫基，如無特別限定，則代表烷硫基之烷基部分具有前述含意之碳數 1~6 之直鏈或分支鏈之烷基-S-

基，例如甲硫基或乙硫基等基。

$C_1\sim C_6$ 烷基亞磺醯基，如無特別限定，則指烷基亞磺醯基之烷基部分具有前述含意之碳數 1~6 之直鏈或分支鏈之烷基-S(O)-基，例如甲基亞磺醯基或乙基亞磺醯基等基。

$C_1\sim C_6$ 烷基磺醯基，如無特別限定，則指烷基磺醯基之烷基部分具有前述含意之碳數 1~6 之直鏈或分支鏈之烷基-S(O)₂-基，例如甲基磺醯基或乙基磺醯基等基。

$C_1\sim C_6$ 烷硫基 $C_1\sim C_6$ 烷基，如無特別限定，則指烷基部分及烷硫基之烷基部分具有前述含意之經碳數 1~6 之烷硫基取代之碳數 1~6 之烷基，例如甲硫基甲基或乙硫基甲基等基。

$C_1\sim C_6$ 烷基亞磺醯基 $C_1\sim C_6$ 烷基，如無特別限定，則指烷基部分及烷基亞磺醯基之烷基部分具有前述含意之經碳數 1~6 之烷基亞磺醯基取代之碳數 1~6 之烷基，例如甲基亞磺醯基甲基或乙基亞磺醯基甲基等基。

$C_1\sim C_6$ 烷基磺醯基 $C_1\sim C_6$ 烷基，如無特別限定，則指烷基部分及烷基磺醯基之烷基部分具有前述含意之經碳數 1~6 之烷基磺醯基取代之碳數 1~6 之烷基，例如甲基磺醯基甲基或乙基磺醯基甲基等基。

$C_1\sim C_6$ 烷氧基 $C_1\sim C_6$ 烷基，如無特別限定，則指烷基部分及烷氧基部分具有前述含意之經碳數 1~6 之烷氧基取代之碳數 1~6 之烷基，例如甲氧基甲基、乙氧基甲基、異丙氧基甲基、戊氧基甲基、甲氧基乙基或丁氧基乙基等基。

苯氧基 $C_1\sim C_6$ 烷基，如無特別限定，則指烷基部分具有

前述含意之經苯基-O-基取代之碳數 1~6 之烷基，例如苯氧基乙基、4-三氟甲基苯氧基丙基或 2-(2-氯苯氧基)丙基等基。

$C_1\sim C_6$ 鹵烷氧基 $C_1\sim C_6$ 烷基，如無特別限定，則指鹵烷氧基部分及烷基部分具有前述含意之經碳數 1~6 之鹵烷氧基取代之碳數 1~6 之烷基，例如氯甲氧基甲基、二氟甲氧基甲基、氯二氟甲氧基甲基、三氟甲氧基甲基或 2,2,2-三氟乙氧基甲基等基。

$C_1\sim C_6$ 烷氧基亞胺基 $C_1\sim C_6$ 烷基，如無特別限定，則指烷氧基部分及烷基部分具有上述含意之經碳數 1~6 之(烷氧基)-N=取代之碳數 1~6 之烷基，例如 2-甲氧基亞胺基乙基、3-甲氧基亞胺基丙基或 1-甲氧基亞胺基乙基等基。

羥基亞胺基 $C_1\sim C_4$ 烷基，如無特別限定，則指經 HO-N=取代之碳數 1~4 之烷基，例如羥基亞胺基甲基、羥基亞胺基乙基等基。

三($C_1\sim C_6$ 烷基)甲矽烷基 $C_1\sim C_6$ 烷基，如無特別限定，則指烷基部分具有前述含意之經三($C_3\sim C_6$ 烷基)-Si-基取代之碳數 1~6 之烷基，例如三甲基甲矽烷基甲基、2-三甲基甲矽烷基乙基、3-三甲基甲矽烷基丙基或 4-三甲基甲矽烷基丁基等。

苯基 $C_1\sim C_6$ 烷基，如無特別限定，則指烷基部分具有前述含意之經苯基取代之碳數 1~6 之烷基，例如苄基、1-苯基乙基或 2-苯基乙基等。

苯基 $C_2\sim C_6$ 烯基，如無特別限定，則指烷基部分具有前

述含意之經苯基取代之碳數 2~6 之烯基，例如苯乙烯基或 3-苯基-2-丙烯基等。

具有可相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中 1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環基，如無特別限定，例如吡啶、嘧啶、吡嗪、噻吩、1,3,5-三嗪、1,2,4-三嗪、吡咯、吡唑、咪唑、1,3,4-三唑、1,2,4-三唑、1,2,3-三唑、四唑、呋喃、噁唑、異噁唑、1,2,4-噁二唑、1,3,4-噁二唑、噻吩、噻唑、異噻唑、1,3,4-噻二唑、1,2,4-噻二唑、1,2,3-噻二唑、喹啉、吲哚、苯并呋喃、苯并噻吩、苯并咪唑、苯并噁唑、苯并異噁唑、苯并噻唑、苯并異噻唑、環氧乙烷、氧雜環戊烷或異噁唑啉等。又，前述雜環基含有氮原子時，也可氧化成 N-氧化物。

經具有可相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中 1 至 5 個雜原子的碳數 1 至 9 之雜環取代的 $C_1 \sim C_6$ 烷基，如無特別限定，代表烷基部分具有前述含意之雜環有取代的碳數 1~6 之烷基，例如(四氫呋喃-2-基)甲基、(4,5-二氫異噁唑-5-基)甲基、(異噁唑-5-基)甲基或(噻吩-2-基)甲基等。

經具有可相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中 1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環取代之 $C_2 \sim C_6$ 烯基，如無特別限定，代表烷基部分具有前述含意之雜環有取代的碳數 1~6 之烷基，例如 5-(四氫呋喃-2-基)乙烯基或 3-(4,5-二氫異噁唑-5-基)-2-丙烯基等。

氰基 $C_1 \sim C_6$ 烷基，如無特別限定，代表烷基部分具有前

述含意之經氟基取代之碳數 1~6 之烷基，例如氟基甲基或 1-氟基丁基等。

gem-二($C_1\sim C_6$ 烷氧基) $C_1\sim C_6$ 烷基，如無特別限定，代表同一碳有具有前述含意的 2 個烷氧基取代的碳數 1~6 之烷基，例如二乙氧基甲基或 2-二甲氧基丙基等。

羥基 $C_1\sim C_6$ 烷基，如無特別限定，代表烷基部分有羥基取代的碳數 1~6 之烷基，例如 2-羥基乙基、3-羥基-正丁基或 3-羥基-正丙基等。

$C_1\sim C_6$ 烷基羰基，如無特別限定，代表烷基部分具有前述含意之烷基- $C(=O)-$ ，例如乙醯基或異丁醯基等。

$C_1\sim C_6$ 烷氧基羰基，如無特別限定，代表烷氧基部分具有前述含意之烷氧基- $C(=O)-$ ，例如甲氧基羰基或異丙氧基羰基等。

胺基 $C_1\sim C_6$ 烷基，如無特別限定，代表烷基部分有胺基取代之碳數 1~6 之烷基，例如 2-胺基乙基、3-胺基-正丁基或 3-胺基-正丙基等。

農業上可容許之鹽，例如鈉或鉀等鹼金屬之鹽；鈣、鎂或鋇等鹼土類金屬之鹽；錳、銅、鋅或鐵等過渡金屬之鹽；銨鹽（氮原子也可視需要取代為 1-4 個碳數 1-4 之烷基及/或 1 個苯基或苄基取代基），較佳為二異丙基銨、四甲基銨、四丁基銨、三甲基苄基銨；鹽酸、氫溴酸、磷酸或硫酸等無機酸之鹽；甲烷磺酸等 $C_1\sim C_4$ 烷基磺酸、苯磺酸或甲苯磺酸等芳香族磺酸、草酸、馬來酸、富馬酸、乳酸、酒石酸、己二酸或苯甲酸等有機酸之鹽。

其次，具有通式[I]之本發明化合物之代表化合物例，記載於表 1~表 63。但是，本發明化合物不限於此等。又，表中化合物編號，在以後記載中係當做參照。

又，本發明包含的化合物，視取代基種類，有存在 E-體及 Z-體的幾何異構物，但是本發明也包含此等 E-體、Z-體或 E-體及 Z-體以任意比例包含之混合物。又，本發明包含之化合物，有時會由於存在 1 個或 2 個以上不對稱碳原子及不對稱硫原子而有光學異構物存在，但本發明包含所有的光學活性體、消旋體或非鏡像異構物。

本說明書，表中的以下記號，各代表如下述基。

Me	: 甲基
Et	: 乙基
Pr-n	: 正丙基
Pr-i	: 異丙基
Pr-c	: 環丙基
Bu-n	: 正丁基
Bu-s	: 第二丁基
Bu-i	: 異丁基
Bu-t	: 第三丁基
Pen-n	: 正戊基
Pen-c	: 環戊基
Pen-i	: 異戊基
Pen-neo	: 新戊基
Pen-2	: 2-戊基

Pen-3 : 3-戊基

Hex-n : 正己基

Hex-c : 環己基

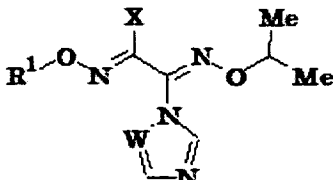
又，例如以下記號，各代表如下含意。

5-CF₃ : 5位有三氟甲基取代

3-Cl-5-CF₃ : 3位有氯原子、5位有三氟甲基取代

2,6-(Cl)₂ : 2位及6位有氯原子取代

【表 1】

			
化合物編號	R¹	X	W
I-1	Me	Cl	N
I-2	Et	Cl	N
I-3	Pr-n	Cl	N
I-4	Pr-i	Cl	N
I-5	Bu-n	Cl	N
I-6	Bu-i	Cl	N
I-7	Bu-s	Cl	N
I-8	Bu-t	Cl	N
I-9	Pen-n	Cl	N
I-10	Pen-i	Cl	N
I-11	Pen-neo	Cl	N
I-12	Pen-2	Cl	N
I-13	Pen-3	Cl	N
I-14	Hex-n	Cl	N
I-15	CH₂CH₂C(Me)₃	Cl	N
I-16	Pen-c	Cl	N
I-17	Hex-c	Cl	N
I-18	CH₂Pr-c	Cl	N
I-19	CH₂Bu-c	Cl	N
I-20	CH₂Pen-c	Cl	N
I-21	CH₂CH=CH₂	Cl	N
I-22	CH₂C≡CH	Cl	N
I-23	CH₂C≡CCH₃	Cl	N
I-24	Me	H	N
I-25	Et	H	N
I-26	Pr-n	H	N
I-27	Pr-i	H	N
I-28	Bu-n	H	N
I-29	Bu-i	H	N
I-30	Bu-s	H	N
I-31	Bu-t	H	N
I-32	Pen-n	H	N

【表 2】

化合物編號	R ¹	X	W
I-33	Pen-i	H	N
I-34	Pen-neo	H	N
I-35	Pen-2	H	N
I-36	Pen-3	H	N
I-37	Hex-n	H	N
I-38	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	H	N
I-39	Pen-t	H	N
I-40	Hex-t	H	N
I-41	CH ₂ Pr-t	H	N
I-42	CH ₂ Bu-t	H	N
I-43	CH ₂ Pen-t	H	N
I-44	CH ₂ CH=CH ₂	H	N
I-45	CH ₂ C≡CH	H	N
I-46	CH ₂ C≡CCH ₃	H	N
I-47	Me	CN	N
I-48	Et	CN	N
I-49	Pr-n	CN	N
I-50	Pr-i	CN	N
I-51	Bu-n	CN	N
I-52	Bu-i	CN	N
I-53	Bu-s	CN	N
I-54	Bu-t	CN	N
I-55	Pen-n	CN	N
I-56	Pen-i	CN	N
I-57	Pen-neo	CN	N
I-58	Pen-2	CN	N
I-59	Pen-3	CN	N
I-60	Hex-n	CN	N
I-61	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CN	N
I-62	Pen-t	CN	N
I-63	Hex-t	CN	N
I-64	CH ₂ Pr-t	CN	N
I-65	CH ₂ Bu-t	CN	N
I-66	CH ₂ Pen-t	CN	N
I-67	CH ₂ CH=CH ₂	CN	N
I-68	CH ₂ C≡CH	CN	N

【表 3】

化合物編號	R ¹	X	W
I-69	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$	CN	N
I-70	Me	CONH_2	N
I-71	Et	CONH_2	N
I-72	Pr-n	CONH_2	N
I-73	Pr-i	CONH_2	N
I-74	Bu-n	CONH_2	N
I-75	Bu-i	CONH_2	N
I-76	Bu-s	CONH_2	N
I-77	Bu-t	CONH_2	N
I-78	Pen-n	CONH_2	N
I-79	Pen-i	CONH_2	N
I-80	Pen-neo	CONH_2	N
I-81	Pen-2	CONH_2	N
I-82	Pen-3	CONH_2	N
I-83	Hex-n	CONH_2	N
I-84	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})_3$	CONH_2	N
I-85	Pen-c	CONH_2	N
I-86	Hex-c	CONH_2	N
I-87	$\text{CH}_2\text{Pr-c}$	CONH_2	N
I-88	$\text{CH}_2\text{Bu-c}$	CONH_2	N
I-89	$\text{CH}_2\text{Pen-c}$	CONH_2	N
I-90	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	CONH_2	N
I-91	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$	CONH_2	N
I-92	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$	CONH_2	N
I-93	Me	Me	N
I-94	Et	Me	N
I-95	Pr-n	Me	N
I-96	Pr-i	Me	N
I-97	Bu-n	Me	N
I-98	Bu-i	Me	N
I-99	Bu-s	Me	N
I-100	Bu-t	Me	N
I-101	Pen-n	Me	N
I-102	Pen-i	Me	N
I-103	Pen-neo	Me	N
I-104	Pen-2	Me	N
I-105	Pen-3	Me	N
I-106	Hex-n	Me	N

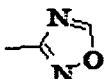
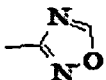
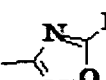
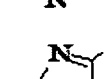
【表 4】

化合物編號	R ¹	X	W
I-107	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N
I-108	Pen-c	Me	N
I-109	Hex-c	Me	N
I-110	CH ₂ Pr-c	Me	N
I-111	CH ₂ Bu-c	Me	N
I-112	CH ₂ Pen-c	Me	N
I-113	CH ₂ CH=CH ₂	Me	N
I-114	CH ₂ C≡CH	Me	N
I-115	CH ₂ C≡CCH ₃	Me	N
I-116	Me	NH ₂	N
I-117	Et	NH ₂	N
I-118	Pr-n	NH ₂	N
I-119	Pr-i	NH ₂	N
I-120	Bu-n	NH ₂	N
I-121	Bu-i	NH ₂	N
I-122	Bu-s	NH ₂	N
I-123	Bu-t	NH ₂	N
I-124	Pen-n	NH ₂	N
I-125	Pen-i	NH ₂	N
I-126	Pen-neo	NH ₂	N
I-127	Pen-2	NH ₂	N
I-128	Pen-3	NH ₂	N
I-129	Hex-n	NH ₂	N
I-130	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	NH ₂	N
I-131	Pen-c	NH ₂	N
I-132	Hex-c	NH ₂	N
I-133	CH ₂ Pr-c	NH ₂	N
I-134	CH ₂ Bu-c	NH ₂	N
I-135	CH ₂ Pen-c	NH ₂	N
I-136	CH ₂ CH=CH ₂	NH ₂	N
I-137	CH ₂ C≡CH	NH ₂	N
I-138	CH ₂ C≡CCH ₃	NH ₂	N
I-139	Me	Br	N
I-140	Et	Br	N
I-141	Pr-n	Br	N
I-142	Pr-i	Br	N
I-143	Bu-n	Br	N

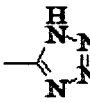
【表 5】

化合物編號	R ¹	X	W
I-144	Bu-i	Br	N
I-145	Bu-s	Br	N
I-146	Bu-t	Br	N
I-147	Pen-n	Br	N
I-148	Pen-i	Br	N
I-149	Pen-neo	Br	N
I-150	Pen-2	Br	N
I-151	Pen-3	Br	N
I-152	Hex-n	Br	N
I-153	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Br	N
I-154	Pen-c	Br	N
I-155	Hex-c	Br	N
I-156	CH ₂ Pr-c	Br	N
I-157	CH ₂ Bu-c	Br	N
I-158	CH ₂ Pen-c	Br	N
I-159	CH ₂ CH=CH ₂	Br	N
I-160	CH ₂ C≡CH	Br	N
I-161	CH ₂ C≡CCH ₃	Br	N
I-162	Me	OMe	N
I-163	Et	OMe	N
I-164	Pr-n	OMe	N
I-165	Pr-i	OMe	N
I-166	Bu-n	OMe	N
I-167	Bu-i	OMe	N
I-168	Bu-s	OMe	N
I-169	Bu-t	OMe	N
I-170	Pen-n	OMe	N
I-171	Pen-i	OMe	N
I-172	Pen-neo	OMe	N
I-173	Pen-2	OMe	N
I-174	Pen-3	OMe	N
I-175	Hex-n	OMe	N
I-176	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	OMe	N
I-177	Pen-c	OMe	N
I-178	Hex-c	OMe	N
I-179	CH ₂ Pr-c	OMe	N
I-180	CH ₂ Bu-c	OMe	N

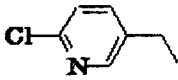
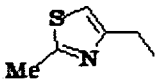
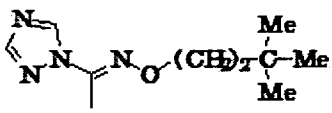
【表 6】

化合物編號	R ¹	X	W
I-181	CH ₂ Pen-c	OMe	N
I-182	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	N
I-183	CH ₂ C≡CH	OMe	N
I-184	CH ₂ C≡CCH ₃	OMe	N
I-185	Me	C(NH ₂)=NOH	
I-186	Et	C(NH ₂)=NOH	N
I-187	Pr-n	C(NH ₂)=NOH	N
I-188	Pr-i	C(NH ₂)=NOH	N
I-189	Bu-n	C(NH ₂)=NOH	N
I-190	Bu-i	C(NH ₂)=NOH	N
I-191	Bu-s	C(NH ₂)=NOH	N
I-192	Bu-t	C(NH ₂)=NOH	N
I-193	Pen-n	C(NH ₂)=NOH	N
I-194	Pen-i	C(NH ₂)=NOH	N
I-195	Pen-neo	C(NH ₂)=NOH	N
I-196	Pen-2	C(NH ₂)=NOH	N
I-197	Pen-3	C(NH ₂)=NOH	N
I-198	Hex-n	C(NH ₂)=NOH	N
I-199	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	C(NH ₂)=NOH	N
I-200	Pen-c	C(NH ₂)=NOH	N
I-201	Hex-c	C(NH ₂)=NOH	N
I-202	CH ₂ Pr-c	C(NH ₂)=NOH	N
I-203	CH ₂ Bu-c	C(NH ₂)=NOH	N
I-204	CH ₂ Pen-c	C(NH ₂)=NOH	N
I-205	CH ₂ CH=CH ₂	C(NH ₂)=NOH	N
I-206	CH ₂ C≡CH	C(NH ₂)=NOH	N
I-207	CH ₂ C≡CCH ₃	C(NH ₂)=NOH	N
I-208	Pr-i		N
I-209	Bu-i		N
I-210	Pr-i		N
I-211	Bu-i		N

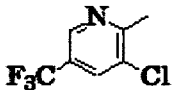
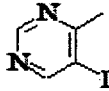
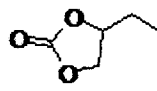
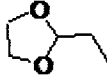
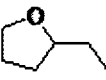
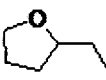
【表 7】

化合物編號	R ¹	X	W
I-212	Pri		N
I-213	Pri		N
I-214	Pri		N
I-215	Pri		N
I-216	Pri	NHCOMe	N
I-217	Bu-i	NHCOMe	N
I-218	CH ₂ Pr-c	NHCOMe	N
I-219	Bu-i	NHCO ₂ Me	N
I-220	Pri	NMe ₂	N
I-221	Pri	CO ₂ Me	N
I-222	Pri	COSMe	N
I-223	Pri	C(=NH)OMe	N
I-224	Pri	CSNH ₂	N
I-225	Pri	CONHMe	N
I-226	Pri	CONMe ₂	N
I-227	Pri	CON(Me)OMe	N
I-228	Pri	SMe	N
I-229	Pri	CF ₃	N
I-230	Pri	Et	N
I-231	Pri	Pri	N
I-232	Pri	Bu-t	N
I-233	CH ₂ (CH ₂) ₅ CH ₃	Cl	N
I-234	CH ₂ (CH ₂) ₈ CH ₃	NH ₂	N
I-235	CH ₂ (CH ₂) ₈ CH ₃	Cl	N
I-236	CH ₂ CF ₃	CN	N
I-237	CH ₂ CF ₃	CONH ₂	N
I-238	CH ₂ CF ₃	H	N
I-239	CH ₂ Ph	Cl	N
I-240	CH ₂ Ph	CN	N
I-241	CH ₂ Ph	CONH ₂	N
I-242	CH ₂ CH ₂ CH(OMe)CH ₃	NH ₂	N
I-243	CH ₂ CH ₂ CH(OMe)CH ₃	Cl	N

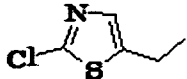
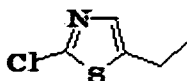
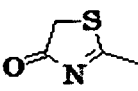
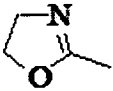
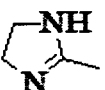
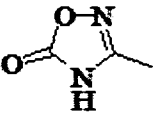
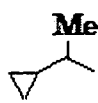
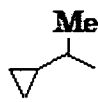
【表 8】

化合物編號	R'	X	W
I-244	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_3$	H	N
I-245	$\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{OCH}_3$	NH_2	N
I-246	$\text{CH}(\text{Me})\text{CH}_2\text{OCH}_3$	Cl	N
I-247	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(\text{CH}_3)_3$	NH_2	N
I-248	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$	Cl	N
I-249	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SC}(\text{CH}_3)_3$	NH_2	N
I-250	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}(\text{CH}_3)_2$	CN	N
I-251	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}(\text{CH}_3)_2$	CONH_2	N
I-252	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SOCH}(\text{CH}_3)_2$	CONH_2	N
I-253	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$	CONH_2	N
I-254		CN	N
I-255		CONH_2	N
I-256		CONH_2	N
I-257	$\text{CH}_2\text{Si}(\text{CH}_3)_3$	NH_2	N
I-258	$\text{CH}_2\text{Si}(\text{CH}_3)_3$	Cl	N
I-259	$\text{CH}_2(\text{CH}_2)_2\text{Si}(\text{CH}_3)_3$	NH_2	N
I-260	$\text{CH}_2(\text{CH}_2)_2\text{Si}(\text{CH}_3)_3$	Cl	N
I-261	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	$\text{C}(\text{NMe}_2)=\text{NOMe}$	N
I-262	Et	$\text{C}(\text{NH}_2)=\text{NOBu-i}$	N
I-263	Et	$\text{C}(\text{Cl})=\text{NOBu-i}$	N
I-264	Et	$\text{C}(\text{NH}_2)=\text{NOCH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})_3$	N
I-265	Et	$\text{C}(\text{Cl})=\text{NOCH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})_3$	N
I-266	Et		N
I-267	Me	OBu-i	N
I-268	$\text{COCH}_2\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_3$	NH_2	N
I-269	Pr-i	NH_2	CH
I-270	Pr-i	Cl	CH
I-271	Pr-i	CN	CH
I-272	Pr-i	CONH_2	CH
I-273	Pr-i	Me	CH
I-274	CH_2CF_3	CN	CH

【表 9】

化合物編號	R ¹	X	W
I-275	CH ₂ CF ₃	CONH ₂	CH
I-276	Bu-i	CONH ₂	CH
I-277	CH ₂ Pr-c	CONH ₂	CH
I-278	Ph	CONH ₂	N
I-279		CONH ₂	N
I-280		CONH ₂	N
I-281	CH(Me)Ph	CONH ₂	N
I-282		CONH ₂	N
I-283		CONH ₂	N
I-284		CONH ₂	N
I-285		CONH ₂	N
I-286		CN	N
I-287		CONH ₂	N
I-288	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CN	N
I-289	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CONH ₂	N
I-290	CH ₂ CN	CONH ₂	N
I-291	Pr-i	SOMe	N
I-292	Pr-i	SO ₂ Me	N
I-293	Pr-i	CH ₂ Pr-c	N
I-294	Pr-i	CH ₂ CH=CH ₂	N
I-295	Pr-i	CH ₂ C≡CH	N
I-296	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CN	N
I-297	CH ₂ C(CH ₃)=CH ₂	CONH ₂	N
I-298	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	CN	N
I-299	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	CONH ₂	N
I-300	CH ₂ C(Cl)=CHCl(trans)	CN	N

【表 10】

化合物編號	R ¹	X	W
I-301	$\text{CH}_2\text{C}(\text{Cl})=\text{CHCl}(\text{trans})$	CONH_2	N
I-302	$\text{CH}_2\text{C}(\text{Cl})=\text{CHCl}(\text{cis})$	CONH_2	N
I-303	Pr-i	$\text{C}(\text{NH}_2)=\text{NOCH}_2\text{CF}_3$	N
I-304	Pr-i	$\text{C}(\text{NH}_2)=\text{NOCO}_2\text{Et}$	N
I-305		CN	N
I-306		CONH_2	N
I-307	Bu-c	CN	N
I-308	Bu-c	CONH_2	N
I-309	Pr-i	Pr-c	N
I-310	Pr-i	CO_2H	N
I-311	Pr-i	Ph	N
I-312	Pr-i		N
I-313	Pr-i		N
I-314	Pr-i		N
I-315	Pr-i		N
I-316	Br 	CN	N
I-317	Br 	CONH_2	N
I-318	$\text{CH}_2\text{Si}(\text{CH}_3)_3$	CN	N
I-319	$\text{CH}_2\text{Si}(\text{CH}_3)_3$	CONH_2	N
I-320	CHF_2	CN	N
I-321	CHF_2	CONH_2	N
I-322	Pr-i	$\text{CONHCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$	N
I-323		CN	N
I-324		CONH_2	N

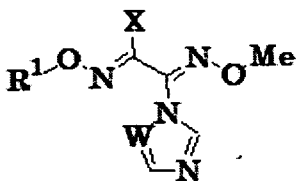
【表 11】

化合物編號	R'	X	W
I-325		CN	N
I-326		CONH ₂	N
I-327	CH ₂ Ph(4-CN)	CN	N
I-328	CH ₂ Ph(4-CN)	CONH ₂	N
I-329	CH ₂ Ph(3-CF ₃)	CN	N
I-330	CH ₂ Ph(3-CF ₃)	CONH ₂	N
I-331	CH ₂ Ph(4-CF ₃)	CN	N
I-332	CH ₂ Ph(4-CF ₃)	CONH ₂	N
I-333	CH ₂ Ph(4-OCH ₃)	CN	N
I-334	CH ₂ Ph(4-OCH ₃)	CONH ₂	N
I-335	CH ₂ Ph(4-Cl)	CN	N
I-336	CH ₂ Ph(4-Cl)	CONH ₂	N
I-337	CH ₂ Ph(4-CH ₃)	CN	N
I-338	CH ₂ Ph(4-CH ₃)	CONH ₂	N
I-339	CH ₂ CH ₂ Ph	CN	N
I-340	CH ₂ CH ₂ Ph	CONH ₂	N
I-341	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Ph	CN	N
I-342	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Ph	CONH ₂	N
I-343	CH(CH ₃)Ph	CN	N
I-344	CH(CH ₃)Ph	CONH ₂	N
I-345	Pr-i	Ph(2-CF ₃)	N
I-346	Pr-i	Ph(2-CH ₃)	N
I-347	CH ₂ Ph(3-CN)	CN	N
I-348	CH ₂ Ph(3-OCH ₃)	CN	N
I-349	CH ₂ Ph(3-OCH ₃)	CONH ₂	N
I-350	Pen-neo	CSNH ₂	N
I-351	CH ₂ (CH ₂) ₆ CH ₃	CN	N
I-352	CH ₂ (CH ₂) ₆ CH ₃	CONH ₂	N
I-353	Pr-i	Ph(4-Cl)	N
I-354	Pr-i	Ph(4-F)	N
I-355	CH ₂ (CH ₂) ₈ CH ₃	CN	N
I-356	CH ₂ (CH ₂) ₈ CH ₃	CONH ₂	N
I-357	CH ₂ Ph(4-F)	CN	N
I-358	CH ₂ Ph(4-F)	CONH ₂	N
I-359	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CN	N
I-360	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CONH ₂	N

【表 12】

化合物編號	R ¹	X	W
I-361	CH ₂ Ph(2-CF ₃)	CN	N
I-362	CH ₂ Ph(2-CF ₃)	CONH ₂	N
I-363	CH ₂ Ph(2-CN)	CN	N
I-364	CH ₂ Ph(2-CN)	CONH ₂	N
I-365	CH ₂ Ph(4-CO ₂ CH ₂ CH ₃)	CN	N
I-366	CH ₂ C≡Cl	CONH ₂	N
I-367	CH ₂ Ph(2-OCH ₃)	CN	N
I-368	CH ₂ Ph(2-OCH ₃)	CONH ₂	N
I-369	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CN	N
I-370	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CONH ₂	N
I-371	Pr-i	Ph(2-Cl)	N
I-372	Pr-i	Ph(3-Cl)	N
I-373	CH ₂ Pr-c	NHSO ₂ NHCO ₂ Bu-t	N
I-374	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CN	N
I-375	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CONH ₂	N
I-376	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CN	N
I-377	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CONH ₂	N
I-378	Pr-i	Ph(2-OCH ₃)	N
I-379	CH(CH ₃)CF ₃	CN	N
I-380	CH(CH ₃)CF ₃	CONH ₂	N
I-381	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CN	N
I-382	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CONH ₂	N
I-383	CH ₂ Ph(2-CH ₃)	CN	N
I-384	CH ₂ Ph(2-CH ₃)	CONH ₂	N
I-385	CH ₂ Ph(3-CH ₃)	CN	N
I-386	CH ₂ Ph(3-CH ₃)	CONH ₂	N
I-387	CH ₂ Ph(2,6-di-CH ₃)	CN	N
I-388	CH ₂ Ph(2,6-di-CH ₃)	CONH ₂	N
I-389	Pr-i	CONHPh	N
I-390	Pr-i	CONHCH ₂ CN	N
I-391	Pr-i	CH ₂ OH	N
I-392	Pr-i	CH ₂ Cl	N
I-393	Pr-i	CH ₂ CN	N
I-394	Pr-i	COCH ₃	N
I-395	Pr-i	SO ₂ CH ₃	N
I-396	Pr-i	SOCH ₃	N
I-397	Pr-i	I	N
I-398	Pr-i	Ph(2-CH ₃)	N

【表 13】

			
化合物編號	R¹	X	W
II-1	Me	Cl	N
II-2	Et	Cl	N
II-3	Pr-n	Cl	N
II-4	Pr-i	Cl	N
II-5	Bu-n	Cl	N
II-6	Bu-i	Cl	N
II-7	Bu-s	Cl	N
II-8	Bu-t	Cl	N
II-9	Pen-n	Cl	N
II-10	Pen-i	Cl	N
II-11	Pen-neo	Cl	N
II-12	Pen-2	Cl	N
II-13	Pen-3	Cl	N
II-14	Hex-n	Cl	N
II-15	CH₂CH₂C(Me)₃	Cl	N
II-16	Pen-c	Cl	N
II-17	Hex-c	Cl	N
II-18	CH₂Pr-c	Cl	N
II-19	CH₂Bu-c	Cl	N
II-20	CH₂Pen-c	Cl	N
II-21	CH₂CH=CH₂	Cl	N
II-22	CH₂C≡CH	Cl	N
II-23	CH₂C≡CCH₃	Cl	N
II-24	Me	H	N
II-25	Et	H	N
II-26	Pr-n	H	N
II-27	Pr-i	H	N
II-28	Bu-n	H	N
II-29	Bu-i	H	N
II-30	Bu-s	H	N
II-31	Bu-t	H	N
II-32	Pen-n	H	N

【表 14】

化合物編號	R ¹	X	W
II-33	Pen-i	H	N
II-34	Pen-neo	H	N
II-35	Pen-2	H	N
II-36	Pen-3	H	N
II-37	Hex-n	H	N
II-38	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	H	N
II-39	Pen-t	H	N
II-40	Hex-t	H	N
II-41	CH ₂ Pr-t	H	N
II-42	CH ₂ Bu-t	H	N
II-43	CH ₂ Pen-t	H	N
II-44	CH ₂ CH=CH ₂	H	N
II-45	CH ₂ C≡CH	H	N
II-46	CH ₂ C≡CCH ₃	H	N
II-47	Me	CN	N
II-48	Et	CN	N
II-49	Pr-n	CN	N
II-50	Pr-i	CN	N
II-51	Bu-n	CN	N
II-52	Bu-i	CN	N
II-53	Bu-s	CN	N
II-54	Bu-t	CN	N
II-55	Pen-n	CN	N
II-56	Pen-i	CN	N
II-57	Pen-neo	CN	N
II-58	Pen-2	CN	N
II-59	Pen-3	CN	N
II-60	Hex-n	CN	N
II-61	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CN	N
II-62	Pen-t	CN	N
II-63	Hex-t	CN	N
II-64	CH ₂ Pr-t	CN	N
II-65	CH ₂ Bu-t	CN	N
II-66	CH ₂ Pen-t	CN	N
II-67	CH ₂ CH=CH ₂	CN	N
II-68	CH ₂ C≡CH	CN	N
II-69	CH ₂ C≡CCH ₃	CN	N

【表 15】

化合物編號	R ¹	X	W
II-70	Me	CONH ₂	N
II-71	Et	CONH ₂	N
II-72	Pr-n	CONH ₂	N
II-73	Pr-i	CONH ₂	N
II-74	Bu-n	CONH ₂	N
II-75	Bu-i	CONH ₂	N
II-76	Bu-s	CONH ₂	N
II-77	Bu-t	CONH ₂	N
II-78	Pen-n	CONH ₂	N
II-79	Pen-i	CONH ₂	N
II-80	Pen-neo	CONH ₂	N
II-81	Pen-2	CONH ₂	N
II-82	Pen-3	CONH ₂	N
II-83	Hex-n	CONH ₂	N
II-84	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CONH ₂	N
II-85	Pen-c	CONH ₂	N
II-86	Hex-c	CONH ₂	N
II-87	CH ₂ Pr-c	CONH ₂	N
II-88	CH ₂ Bu-c	CONH ₂	N
II-89	CH ₂ Pen-c	CONH ₂	N
II-90	CH ₂ CH=CH ₂	CONH ₂	N
II-91	CH ₂ C≡CH	CONH ₂	N
II-92	CH ₂ C≡CCH ₃	CONH ₂	N
II-93	Me	Me	N
II-94	Et	Me	N
II-95	Pr-n	Me	N
II-96	Pr-i	Me	N
II-97	Bu-n	Me	N
II-98	Bu-i	Me	N
II-99	Bu-s	Me	N
II-100	Bu-t	Me	N
II-101	Pen-n	Me	N
II-102	Pen-i	Me	N
II-103	Pen-neo	Me	N
II-104	Pen-2	Me	N
II-105	Pen-3	Me	N
II-106	Hex-n	Me	N

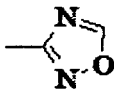
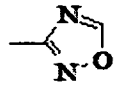
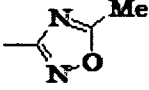
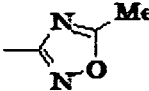
【表 16】

化合物編號	R ¹	X	W
II-107	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N
II-108	Pen-c	Me	N
II-109	Hex-c	Me	N
II-110	CH ₂ Pr-c	Me	N
II-111	CH ₂ Bu-c	Me	N
II-112	CH ₂ Pen-c	Me	N
II-113	CH ₂ CH=CH ₂	Me	N
II-114	CH ₂ C≡CH	Me	N
II-115	CH ₂ C≡CCH ₃	Me	N
II-116	Me	NH ₂	N
II-117	Et	NH ₂	N
II-118	Pr-n	NH ₂	N
II-119	Pr-i	NH ₂	N
II-120	Bu-n	NH ₂	N
II-121	Bu-i	NH ₂	N
II-122	Bu-s	NH ₂	N
II-123	Bu-t	NH ₂	N
II-124	Pen-n	NH ₂	N
II-125	Pen-i	NH ₂	N
II-126	Pen-neo	NH ₂	N
II-127	Pen-2	NH ₂	N
II-128	Pen-3	NH ₂	N
II-129	Hex-n	NH ₂	N
II-130	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	NH ₂	N
II-131	Pen-c	NH ₂	N
II-132	Hex-c	NH ₂	N
II-133	CH ₂ Pr-c	NH ₂	N
II-134	CH ₂ Bu-c	NH ₂	N
II-135	CH ₂ Pen-c	NH ₂	N
II-136	CH ₂ CH=CH ₂	NH ₂	N
II-137	CH ₂ C≡CH	NH ₂	N
II-138	CH ₂ C≡CCH ₃	NH ₂	N
II-139	Me	Br	N
II-140	Et	Br	N
II-141	Pr-n	Br	N
II-142	Pr-i	Br	N
II-143	Bu-n	Br	N

【表 17】

化合物編號	R ¹	X	W
II-144	Bu-i	Br	N
II-145	Bu-s	Br	N
II-146	Bu-t	Br	N
II-147	Pen-n	Br	N
II-148	Pen-i	Br	N
II-149	Pen-neo	Br	N
II-150	Pen-2	Br	N
II-151	Pen-3	Br	N
II-152	Hex-n	Br	N
II-153	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Br	N
II-154	Pen-c	Br	N
II-155	Hex-c	Br	N
II-156	CH ₂ Pr-c	Br	N
II-157	CH ₂ Bu-c	Br	N
II-158	CH ₂ Pen-c	Br	N
II-159	CH ₂ CH=CH ₂	Br	N
II-160	CH ₂ C≡CH	Br	N
II-161	CH ₂ C≡CCH ₃	Br	N
II-162	Me	OMe	N
II-163	Et	OMe	N
II-164	Pr-n	OMe	N
II-165	Pr-i	OMe	N
II-166	Bu-n	OMe	N
II-167	Bu-i	OMe	N
II-168	Bu-s	OMe	N
II-169	Bu-t	OMe	N
II-170	Pen-n	OMe	N
II-171	Pen-i	OMe	N
II-172	Pen-neo	OMe	N
II-173	Pen-2	OMe	N
II-174	Pen-3	OMe	N
II-175	Hex-n	OMe	N
II-176	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	OMe	N
II-177	Pen-c	OMe	N
II-178	Hex-c	OMe	N
II-179	CH ₂ Pr-c	OMe	N
II-180	CH ₂ Bu-c	OMe	N

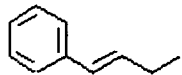
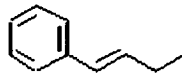
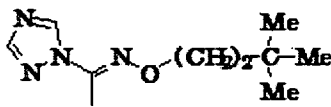
【表 18】

化合物編號	R ¹	X	W
II-181	CH ₂ Pen-c	OMe	N
II-182	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	N
II-183	CH ₂ C≡CH	OMe	N
II-184	CH ₂ C≡CCH ₃	OMe	N
II-185	Me	C(NH ₂)=NOH	N
II-186	Et	C(NH ₂)=NOH	N
II-187	Pr-n	C(NH ₂)=NOH	N
II-188	Pr-i	C(NH ₂)=NOH	N
II-189	Bu-n	C(NH ₂)=NOH	N
II-190	Bu-i	C(NH ₂)=NOH	N
II-191	Bu-s	C(NH ₂)=NOH	N
II-192	Bu-t	C(NH ₂)=NOH	N
II-193	Pen-n	C(NH ₂)=NOH	N
II-194	Pen-i	C(NH ₂)=NOH	N
II-195	Pen-neo	C(NH ₂)=NOH	N
II-196	Pen-2	C(NH ₂)=NOH	N
II-197	Pen-3	C(NH ₂)=NOH	N
II-198	Hex-n	C(NH ₂)=NOH	N
II-199	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	C(NH ₂)=NOH	N
II-200	Pen-c	C(NH ₂)=NOH	N
II-201	Hex-c	C(NH ₂)=NOH	N
II-202	CH ₂ Pr-c	C(NH ₂)=NOH	N
II-203	CH ₂ Bu-c	C(NH ₂)=NOH	N
II-204	CH ₂ Pen-c	C(NH ₂)=NOH	N
II-205	CH ₂ CH=CH ₂	C(NH ₂)=NOH	N
II-206	CH ₂ C≡CH	C(NH ₂)=NOH	N
II-207	CH ₂ C≡CCH ₃	C(NH ₂)=NOH	N
II-208	Pr-i		N
II-209	Bu-i		N
II-210	Pr-i		N
II-211	Bu-i		N

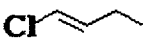
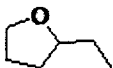
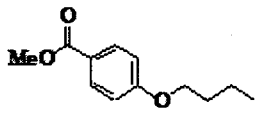
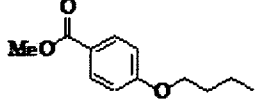
【表 19】

化合物編號	R ¹	X	W
II-212	Pr-i		N
II-213	Pr-i		N
II-214	Pr-i		N
II-215	Pr-i		N
II-216	Pr-i	NHCOMe	N
II-217	Bu-i	NHCOMe	N
II-218	CH ₂ Pr-c	NHCOMe	N
II-219	Bu-i	NHCO ₂ Me	N
II-220	Pr-i	NMe ₂	N
II-221	Pr-i	CO ₂ Me	N
II-222	Pr-i	COSEt	N
II-223	Pr-i	C(=NH)OMe	N
II-224	Pr-i	CSNH ₂	N
II-225	Pr-i	CONHMe	N
II-226	Pr-i	CONMe ₂	N
II-227	Pr-i	CON(Me)OMe	N
II-228	Pr-i	SMe	N
II-229	Pr-i	CF ₃	N
II-230	Pr-i	Et	N
II-231	Pr-i	Pr-i	N
II-232	Pr-i	Bu-t	N
II-233	CH ₂ (CH ₂) ₅ CH ₃	Cl	N
II-234	CH ₂ (CH ₂) ₈ CH ₃	NH ₂	N
II-235	CH ₂ (CH ₂) ₆ CH ₃	CN	N
II-236	CH ₂ (CH ₂) ₈ CH ₃	CN	N
II-237	CH ₂ (CH ₂) ₆ CH ₃	CONH ₂	N
II-238	CH ₂ (CH ₂) ₈ CH ₃	CONH ₂	N
II-239	CH ₂ (CH ₂) ₈ CH ₃	Cl	N
II-240	CH ₂ CF ₃	CN	N
II-241	CH ₂ CF ₃	CONH ₂	N
II-242	CH ₂ CF ₃	H	N

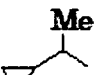
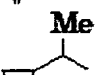
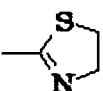
【表 20】

化合物編號	R'	X	W
II-243	CH ₂ Ph	Cl	N
II-244	CH ₂ Ph	CN	N
II-245	CH ₂ Ph	CONH ₂	N
II-246		CN	N
II-247		CONH ₂	N
II-248	CH ₂ CH ₂ CH(OMe)CH ₃	NH ₂	N
II-249	CH ₂ CH ₂ CH(OMe)CH ₃	Cl	N
II-250	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	N
II-251	CH(Me)CH ₂ OCH ₃	NH ₂	N
II-252	CH(Me)CH ₂ OCH ₃	Cl	N
II-253	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	NH ₂	N
II-254	CH ₂ CH ₂ OH	Cl	N
II-255	CH ₂ CH ₂ SC(CH ₃) ₃	NH ₂	N
II-256	CH ₂ Si(CH ₃) ₃	NH ₂	N
II-257	CH ₂ Si(CH ₃) ₃	Cl	N
II-258	CH ₂ (CH ₂) ₂ Si(CH ₃) ₃	NH ₂	N
II-259	CH ₂ (CH ₂) ₂ Si(CH ₃) ₃	Cl	N
II-260	Et	C(NH ₂)=NOBu-i	N
II-261	Et	C(Cl)=NOBu-i	N
II-262	Et	C(NH ₂)=NOCH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	N
II-263	Et	CONHCH ₂ OCH ₃	N
II-264	Et		N
II-265	Me	OBu-i	N
II-266	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CN	N
II-267	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CONH ₂	N
II-268	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	N
II-269	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CONH ₂	N
II-270	Pr-i	Cl	CH
II-271	Pr-i	CN	CH
II-272	Pr-i	CONH ₂	CH
II-273	Pr-i	Me	CH
II-274	CH ₂ CF ₃	CN	CH

【表 21】

化合物編號	R ¹	X	W
II-275	CH ₂ CF ₃	CONH ₂	CH
II-276	Bu-i	CONH ₂	CH
II-277	CH ₂ Pr-c	CONH ₂	CH
II-278	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CN	N
II-279	CH ₂ CH ₂ CH=CH ₂	CONH ₂	N
II-280		CN	N
II-281		CONH ₂	N
II-282		CN	N
II-283		CONH ₂	N
II-284		CN	N
II-285		CONH ₂	N
II-286		CN	N
II-287		CONH ₂	N
II-288	CH ₂ Hex-c	CN	N
II-289	CH ₂ Hex-c	CONH ₂	N
II-290	Bu-t	CONHBu-t	N
II-291	Bu-i	Pr-c	N
II-292	Bu-i	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	N
II-293	Bu-i	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	N
II-294	Bu-i	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	N
II-295	Pr-i	CH ₂ OCH ₃	N
II-296	Pr-i	Ph	N
II-297	Pr-i	Ph(2-F)	N
II-298	Pr-i	CH ₂ C(=NOMe)CH ₃	N

【表 22】

化合物編號	R ¹	X	W
II-299		CN	N
II-300		CONH ₂	N
II-301		CN	N
II-302		CONH ₂	N
II-303		CN	N
II-304		CONH ₂	N
II-305		CN	N
II-306		CONH ₂	N
II-307		CN	N
II-308		CONH ₂	N
II-309	CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CN	N
II-310	CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CONH ₂	N
II-311	Pen-neo	CSNH ₂	N
II-312	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃	CN	N
II-313	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃	CONH ₂	N
II-314	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	CN	N
II-315	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	CONH ₂	N
II-316		CN	N
II-317		CONH ₂	N
II-318	CH ₂ Pr-c		N

【表 23】

化合物編號	R ¹	X	W
II-319	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CN}$	CN	N
II-320	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CN}$	CONH_2	N
II-321	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{Cl}$	CN	N
II-322	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{Cl}$	CONH_2	N
II-323	CH_2Pr^t	$\text{NHSO}_2\text{NHCO}_2\text{Bu}^t$	N
II-324	$\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$	CN	N
II-325	$\text{CH}_2(\text{CF}_2)_2\text{CF}_3$	CONH_2	N
II-326	$\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	CN	N
II-327	$\text{CH}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	CONH_2	N
II-328	$\text{CH}_2(\text{CH}_2)_2\text{CF}_3$	CN	N
II-329	$\text{CH}_2(\text{CH}_2)_2\text{CF}_3$	CONH_2	N
II-330	$\text{CH}_2(\text{CH}_2)_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	CN	N
II-331	$\text{CH}_2(\text{CH}_2)_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	CONH_2	N
II-332		CN	N
II-333		CONH_2	N
II-334	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$	CN	N
II-335	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$	CONH_2	N
II-336	$\text{CF}_2\text{CHF}_2\text{CF}_3$	CN	N
II-337	$\text{CF}_2\text{CHF}_2\text{CF}_3$	CONH_2	N
II-338		CN	N
II-339		CONH_2	N
II-340		CN	N
II-341		CONH_2	N
II-342		CN	N
II-343		CONH_2	N
II-344	$\text{CH}(\text{CH}_2\text{F})_2$	CN	N

【表 24】

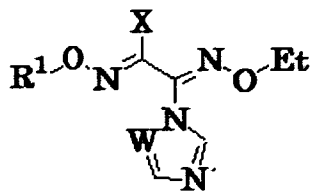
化合物編號	R ¹	X	W
II-345	CH(CH ₂ F) ₂	CONH ₂	N
II-346	CH ₂ Pr-c		
II-347		CN	N
II-348		CONH ₂	N
II-349	CH ₂ CCH ₃ (CF ₃) ₂	CN	N
II-350	CH ₂ CCH ₃ (CF ₃) ₂	CONH ₂	N
II-351	CH ₂ CCH ₃ (CF ₃) ₂	CN	CH
II-352	CH ₂ CCH ₃ (CF ₃) ₂	CONH ₂	CH
II-353		CN	N
II-354		CONH ₂	N
II-355	CH ₂ Si(CH ₃) ₃	CN	N
II-356	CH ₂ Si(CH ₃) ₃	CONH ₂	N
II-357	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CN	N
II-358	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CONH ₂	N
II-359	CH(CH ₃)CF ₃	CN	N
II-360	CH(CH ₃)CF ₃	CONH ₂	N
II-361	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CN	N
II-362	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CONH ₂	N
II-363	CH ₂ Ph(1,2,3,4,5-penta-F)	CN	N
II-364	CH ₂ Ph(1,2,3,4,5-penta-F)	CONH ₂	N
II-365	CH ₂ Ph(3-F)	CN	N
II-366	CH ₂ Ph(3-F)	CONH ₂	N
II-367	CH ₂ Ph(4-F)	CN	N
II-368	CH ₂ Ph(4-F)	CONH ₂	N
II-369		CN	N
II-370		CONH ₂	N

【表 25】

化合物編號	R ¹	X	W
II-371	CH ₂ Pr-c		N
II-372		CONH ₂	N
II-373	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CN	CH
II-374	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CONH ₂	CH
II-375	Me		N
II-376	Me		N
II-377	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CN	N
II-378	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CONH ₂	N
II-379	CH ₂ (CF ₂) ₃ CHF ₂	CN	N
II-380	CH ₂ (CF ₂) ₃ CHF ₂	CONH ₂	N
II-381*	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CONH ₂	CH

*MeSO₂OH鹽

【表 26】

			
化合物編號	R¹	X	W
III-1	Me	Cl	N
III-2	Et	Cl	N
III-3	Pr-n	Cl	N
III-4	Pr-i	Cl	N
III-5	Bu-n	Cl	N
III-6	Bu-i	Cl	N
III-7	Bu-s	Cl	N
III-8	Bu-t	Cl	N
III-9	Pen-n	Cl	N
III-10	Pen-i	Cl	N
III-11	Pen-neo	Cl	N
III-12	Pen-2	Cl	N
III-13	Pen-3	Cl	N
III-14	Hex-n	Cl	N
III-15	CH₂CH₂C(Me)₃	Cl	N
III-16	Pen-c	Cl	N
III-17	Hex-c	Cl	N
III-18	CH₂Pr-c	Cl	N
III-19	CH₂Bu-c	Cl	N
III-20	CH₂Pen-c	Cl	N
III-21	CH₂CH=CH₂	Cl	N
III-22	CH₂C≡CH	Cl	N
III-23	CH₂C≡CCH₃	Cl	N
III-24	Me	H	N
III-25	Et	H	N
III-26	Pr-n	H	N
III-27	Pr-i	H	N
III-28	Bu-n	H	N
III-29	Bu-i	H	N
III-30	Bu-s	H	N
III-31	Bu-t	H	N
III-32	Pen-n	H	N

【表 27】

化合物編號	R ¹	X	W
III-33	Pen-i	H	N
III-34	Pen-neo	H	N
III-35	Pen-2	H	N
III-36	Pen-3	H	N
III-37	Hex-n	H	N
III-38	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	H	N
III-39	Pen-c	H	N
III-40	Hex-c	H	N
III-41	CH ₂ Pr-c	H	N
III-42	CH ₂ Bu-c	H	N
III-43	CH ₂ Pen-c	H	N
III-44	CH ₂ CH=CH ₂	H	N
III-45	CH ₂ C≡CH	H	N
III-46	CH ₂ C≡CCH ₃	H	N
III-47	Me	CN	N
III-48	Et	CN	N
III-49	Pr-n	CN	N
III-50	Pr-i	CN	N
III-51	Bu-n	CN	N
III-52	Bu-i	CN	N
III-53	Bu-s	CN	N
III-54	Bu-t	CN	N
III-55	Pen-n	CN	N
III-56	Pen-i	CN	N
III-57	Pen-neo	CN	N
III-58	Pen-2	CN	N
III-59	Pen-3	CN	N
III-60	Hex-n	CN	N
III-61	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CN	N
III-62	Pen-c	CN	N
III-63	Hex-c	CN	N
III-64	CH ₂ Pr-c	CN	N
III-65	CH ₂ Bu-c	CN	N
III-66	CH ₂ Pen-c	CN	N
III-67	CH ₂ CH=CH ₂	CN	N
III-68	CH ₂ C≡CH	CN	N
III-69	CH ₂ C≡CCH ₃	CN	N

【表 28】

化合物編號	R ¹	X	W
III-70	Me	CONH ₂	N
III-71	Et	CONH ₂	N
III-72	Pr-n	CONH ₂	N
III-73	Pr-i	CONH ₂	N
III-74	Bu-n	CONH ₂	N
III-75	Bu-i	CONH ₂	N
III-76	Bu-s	CONH ₂	N
III-77	Bu-t	CONH ₂	N
III-78	Pen-n	CONH ₂	N
III-79	Pen-i	CONH ₂	N
III-80	Pen-neo	CONH ₂	N
III-81	Pen-2	CONH ₂	N
III-82	Pen-3	CONH ₂	N
III-83	Hex-n	CONH ₂	N
III-84	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CONH ₂	N
III-85	Pen-c	CONH ₂	N
III-86	Hex-c	CONH ₂	N
III-87	CH ₂ Pr-c	CONH ₂	N
III-88	CH ₂ Bu-c	CONH ₂	N
III-89	CH ₂ Pen-c	CONH ₂	N
III-90	CH ₂ CH=CH ₂	CONH ₂	N
III-91	CH ₂ C≡CH	CONH ₂	N
III-92	CH ₂ C≡CCH ₃	CONH ₂	N
III-93	Me	Me	N
III-94	Et	Me	N
III-95	Pr-n	Me	N
III-96	Pr-i	Me	N
III-97	Bu-n	Me	N
III-98	Bu-i	Me	N
III-99	Bu-s	Me	N
III-100	Bu-t	Me	N
III-101	Pen-n	Me	N
III-102	Pen-i	Me	N
III-103	Pen-neo	Me	N
III-104	Pen-2	Me	N
III-105	Pen-3	Me	N
III-106	Hex-n	Me	N

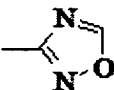
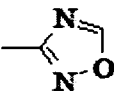
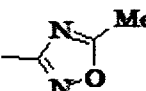
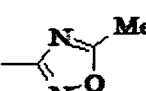
【表 29】

化合物編號	R ¹	X	W
III-107	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	N
III-108	Pen-c	Me	N
III-109	Hex-c	Me	N
III-110	CH ₂ Pr-c	Me	N
III-111	CH ₂ Bu-c	Me	N
III-112	CH ₂ Pen-c	Me	N
III-113	CH ₂ CH=CH ₂	Me	N
III-114	CH ₂ C≡CH	Me	N
III-115	CH ₂ C≡CCH ₃	Me	N
III-116	Me	NH ₂	N
III-117	Et	NH ₂	N
III-118	Pr-n	NH ₂	N
III-119	Pr-i	NH ₂	N
III-120	Bu-n	NH ₂	N
III-121	Bu-i	NH ₂	N
III-122	Bu-s	NH ₂	N
III-123	Bu-t	NH ₂	N
III-124	Pen-n	NH ₂	N
III-125	Pen-i	NH ₂	N
III-126	Pen-neo	NH ₂	N
III-127	Pen-2	NH ₂	N
III-128	Pen-3	NH ₂	N
III-129	Hex-n	NH ₂	N
III-130	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	NH ₂	N
III-131	Pen-c	NH ₂	N
III-132	Hex-c	NH ₂	N
III-133	CH ₂ Pr-c	NH ₂	N
III-134	CH ₂ Bu-c	NH ₂	N
III-135	CH ₂ Pen-c	NH ₂	N
III-136	CH ₂ CH=CH ₂	NH ₂	N
III-137	CH ₂ C≡CH	NH ₂	N
III-138	CH ₂ C≡CCH ₃	NH ₂	N
III-139	Me	Br	N
III-140	Et	Br	N
III-141	Pr-n	Br	N
III-142	Pr-i	Br	N
III-143	Bu-n	Br	N

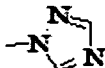
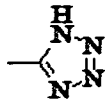
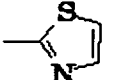
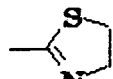
【表 30】

化合物編號	R'	X	W
III-144	Bu-i	Br	N
III-145	Bu-s	Br	N
III-146	Bu-t	Br	N
III-147	Pen-n	Br	N
III-148	Pen-i	Br	N
III-149	Pen-neo	Br	N
III-150	Pen-2	Br	N
III-151	Pen-3	Br	N
III-152	Hex-n	Br	N
III-153	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Br	N
III-154	Pen-c	Br	N
III-155	Hex-c	Br	N
III-156	CH ₂ Pr-c	Br	N
III-157	CH ₂ Bu-c	Br	N
III-158	CH ₂ Pen-c	Br	N
III-159	CH ₂ CH=CH ₂	Br	N
III-160	CH ₂ C≡CH	Br	N
III-161	CH ₂ C≡CCH ₃	Br	N
III-162	Me	OMe	N
III-163	Et	OMe	N
III-164	Pr-n	OMe	N
III-165	Pr-i	OMe	N
III-166	Bu-n	OMe	N
III-167	Bu-i	OMe	N
III-168	Bu-s	OMe	N
III-169	Bu-t	OMe	N
III-170	Pen-n	OMe	N
III-171	Pen-i	OMe	N
III-172	Pen-neo	OMe	N
III-173	Pen-2	OMe	N
III-174	Pen-3	OMe	N
III-175	Hex-n	OMe	N
III-176	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	OMe	N
III-177	Pen-c	OMe	N
III-178	Hex-c	OMe	N
III-179	CH ₂ Pr-c	OMe	N
III-180	CH ₂ Bu-c	OMe	N

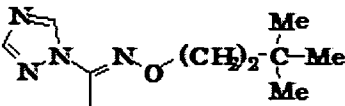
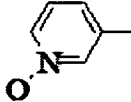
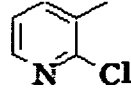
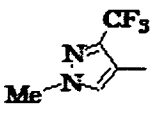
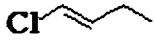
【表 31】

化合物編號	R'	X	W
III-181	CH ₂ Pen-c	OMe	N
III-182	CH ₂ CH=CH ₂	OMe	N
III-183	CH ₂ C≡CH	OMe	N
III-184	CH ₂ C≡CCH ₃	OMe	N
III-185	Me	C(NH ₂)=NOH	N
III-186	Et	C(NH ₂)=NOH	N
III-187	Pr-n	C(NH ₂)=NOH	N
III-188	Pr-i	C(NH ₂)=NOH	N
III-189	Bu-n	C(NH ₂)=NOH	N
III-190	Bu-i	C(NH ₂)=NOH	N
III-191	Bu-s	C(NH ₂)=NOH	N
III-192	Bu-t	C(NH ₂)=NOH	N
III-193	Pen-n	C(NH ₂)=NOH	N
III-194	Pen-i	C(NH ₂)=NOH	N
III-195	Pen-neo	C(NH ₂)=NOH	N
III-196	Pen-2	C(NH ₂)=NOH	N
III-197	Pen-3	C(NH ₂)=NOH	N
III-198	Hex-n	C(NH ₂)=NOH	N
III-199	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	C(NH ₂)=NOH	N
III-200	Pen-c	C(NH ₂)=NOH	N
III-201	Hex-c	C(NH ₂)=NOH	N
III-202	CH ₂ Pr-c	C(NH ₂)=NOH	N
III-203	CH ₂ Bu-c	C(NH ₂)=NOH	N
III-204	CH ₂ Pen-c	C(NH ₂)=NOH	N
III-205	CH ₂ CH=CH ₂	C(NH ₂)=NOH	N
III-206	CH ₂ C≡CH	C(NH ₂)=NOH	N
III-207	CH ₂ C≡CCH ₃	C(NH ₂)=NOH	N
III-208	Pr-i		N
III-209	Bu-i		N
III-210	Pr-i		N
III-211	Bu-i		N

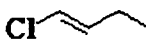
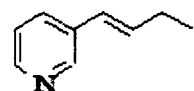
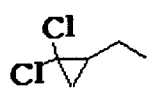
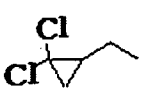
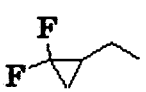
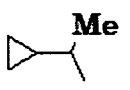
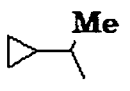
【表 32】

化合物編號	R ¹	X	W
III-212	Pr-i		N
III-213	Pr-i		N
III-214	Pr-i		N
III-215	Pr-i		N
III-216	Pr-i	NHCOMe	N
III-217	Bu-i	NHCOMe	N
III-218	CH ₂ Pr-c	NHCOMe	N
III-219	Bu-i	NHCO ₂ Me	N
III-220	Pr-i	NMe ₂	N
III-221	Pr-i	CO ₂ Me	N
III-222	Pr-i	COSEt	N
III-223	Pr-i	C(=NH)OMe	N
III-224	Pr-i	CSNH ₂	N
III-225	Pr-i	CONHMe	N
III-226	Pr-i	CONMe ₂	N
III-227	Pr-i	CON(Me)OMe	N
III-228	Pr-i	SMe	N
III-229	Pr-i	CF ₃	N
III-230	Pr-i	Et	N
III-231	Pr-i	Pr-i	N
III-232	Pr-i	Bu-t	N
III-233	CH ₂ (CH ₂) ₆ CH ₃	CN	N
III-234	CH ₂ (CH ₂) ₆ CH ₃	CONH ₂	N
III-235	CH ₂ (CH ₂) ₅ CH ₃	Cl	N
III-236	CH ₂ (CH ₂) ₅ CH ₃	NH ₂	N
III-237	CH ₂ (CH ₂) ₈ CH ₃	Cl	N
III-238	CH ₂ CF ₃	CN	N
III-239	CH ₂ CF ₃	CONH ₂	N
III-240	CH ₂ CF ₃	H	N
III-241	CH ₂ Ph	Cl	N
III-242	CH ₂ Ph	CN	N

【表 33】

化合物編號	R ¹	X	W
III-243	CH ₂ Ph	CONH ₂	N
III-244	CH ₂ CH ₂ CH(OMe)CH ₃	NH ₂	N
III-245	CH ₂ CH ₂ CH(OMe)CH ₃	Cl	N
III-246	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	N
III-247	CH(Me)CH ₂ OCH ₃	NH ₂	N
III-248	CH(Me)CH ₂ OCH ₃	Cl	N
III-249	CH ₂ CH ₂ OC(CH ₃) ₃	NH ₂	N
III-250	CH ₂ CH ₂ OH	Cl	N
III-251	CH ₂ CH ₂ SC(CH ₃) ₃	NH ₂	N
III-252	CH ₂ Si(CH ₃) ₃	NH ₂	N
III-253	CH ₂ Si(CH ₃) ₃	Cl	N
III-254	CH ₂ (CH ₂) ₂ Si(CH ₃) ₃	NH ₂	N
III-255	CH ₂ (CH ₂) ₂ Si(CH ₃) ₃	Cl	N
III-256	Et	C(NH ₂)=NOBu-i	N
III-257	Et	CONHPr-c	N
III-258	Et	CONHCHF ₂	N
III-259	Et	CONHSO ₂ CH ₃	N
III-260	Et		N
III-261	Me	OBu-i	N
III-262	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	N
III-263	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CONH ₂	N
III-264	Me		N
III-265	Me		N
III-266	Me		N
III-267	Me		N
III-268	Et		N
III-269		CN	N

【表 34】

化合物編號	R ¹	X	W
III-270		CONH ₂	N
III-271		Me	N
III-272	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CN	N
III-273	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CONH ₂	N
III-274	Pr-i	CO ₂ H	N
III-275	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CN	N
III-276	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CONH ₂	N
III-277	CH ₂ OCH ₃	CN	N
III-278	CH ₂ OCH ₃	CONH ₂	N
III-279	CH ₂ (CH ₂) ₂ OCH ₃	CN	N
III-280	CH ₂ (CH ₂) ₂ OCH ₃	CONH ₂	N
III-281		CN	N
III-282		CONH ₂	N
III-283		CN	N
III-284		CONH ₂	N
III-285		CN	N
III-286		CONH ₂	N
III-287		CN	N
III-288		CONH ₂	N
III-289		CN	N
III-290		CONH ₂	N

【表 35】

化合物編號	R ¹	X	W
III-291		CN	N
III-292		CONH ₂	N
III-293		CN	N
III-294		CONH ₂	N
III-295	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃	CN	N
III-296	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃	CONH ₂	N
III-297	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CN	N
III-298	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CONH ₂	N
III-299	CF ₂ CHFCH ₃	CN	N
III-300	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CN	CN	N
III-301	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CN	CONH ₂	N
III-302	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	CN	N
III-303	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	CONH ₂	N
III-304	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CN	N
III-305	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CONH ₂	N
III-306	Bu-n	C(=NH)OCH ₃	N
III-307	Bu-n	CO ₂ CH ₃	N
III-308	CH ₂ (CF ₂) ₃ CHF ₂	CN	N
III-309	CH ₂ (CF ₂) ₃ CHF ₂	CONH ₂	N

【表 36】

$ \begin{array}{c} \text{X} \\ \\ \text{R}^1\text{O}-\text{N}=\text{C}-\text{N}=\text{O}-\text{R}^2 \\ \\ \text{W}-\text{N} \\ \diagup \quad \diagdown \\ \text{N} \quad \text{N} \end{array} $				
化合物編號	R ¹	X	R ²	W
IV-1	Pr-i	Cl	Pr-n	N
IV-2	Pr-i	Cl	Bu-n	N
IV-3	Pr-i	Cl	Bu-i	N
IV-4	Pr-i	Cl	Bu-t	N
IV-5	Pr-i	Cl	Pen-i	N
IV-6	Pr-i	Cl	CH ₂ Pr-c	N
IV-7	Pr-i	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	N
IV-8	Pr-i	Cl	CH ₂ C≡CH	N
IV-9	Pr-i	Cl	CH ₂ C≡CCH ₃	N
IV-10	Pr-i	Cl	CH ₂ CF ₃	N
IV-11	Pr-i	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N
IV-12	Pr-i	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
IV-13	Pr-i	Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N
IV-14	Pr-i	Cl	CH ₂ (CH ₂) ₃ OC(CH ₃) ₃	N
IV-15	Pr-i	CONH ₂	Pr-n	N
IV-16	Pr-i	CONH ₂	Bu-n	N
IV-17	Pr-i	CONH ₂	Bu-i	N
IV-18	Pr-i	CONH ₂	Bu-s	N
IV-19	Pr-i	CONH ₂	Bu-t	N
IV-20	Pr-i	CONH ₂	Pen-i	N
IV-21	Pr-i	CONH ₂	CH ₂ Pr-c	N
IV-22	Pr-i	CONH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	N
IV-23	Pr-i	CONH ₂	CH ₂ C≡CH	N
IV-24	Pr-i	CONH ₂	CH ₂ C≡CCH ₃	N
IV-25	Pr-i	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	N
IV-26	Pr-i	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N
IV-27	Pr-i	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
IV-28	Pr-i	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N
IV-29	Pr-i	CONH ₂	CH ₂ (CH ₂) ₃ OC(CH ₃) ₃	N
IV-30	Pr-i	CN	Pr-n	N
IV-31	Pr-i	CN	Bu-n	N

【表 37】

化合物編號	R ¹	X	R ²	W
IV-32	Pri	CN	Bu-i	N
IV-33	Pri	CN	Bu-s	N
IV-34	Pri	CN	Bu-t	N
IV-35	Pri	CN	Pen-i	N
IV-36	Pri	CN	CH ₂ Pr-c	N
IV-37	Pri	CN	CH ₂ CH=CH ₂	N
IV-38	Pri	CN	CH ₂ C≡CH	N
IV-39	Pri	CN	CH ₂ C≡CCH ₃	N
IV-40	Pri	CN	CH ₂ CF ₃	N
IV-41	Pri	CN	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N
IV-42	Pri	CN	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
IV-43	Pri	CN	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N
IV-44	Pri	CN	CH ₂ (CH ₂) ₃ OC(CH ₃) ₃	N
IV-45	Me	Cl	Pr-n	N
IV-46	Me	Cl	Bu-n	N
IV-47	Me	Cl	Bu-i	N
IV-48	Me	Cl	Bu-t	N
IV-49	Me	Cl	Pen-i	N
IV-50	Me	Cl	CH ₂ Pr-c	N
IV-51	Me	Cl	CH ₂ CH=CH ₂	N
IV-52	Me	Cl	CH ₂ C≡CH	N
IV-53	Me	Cl	CH ₂ C≡CCH ₃	N
IV-54	Me	Cl	CH ₂ CF ₃	N
IV-55	Me	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N
IV-56	Me	Cl	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
IV-57	Me	Cl	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N
IV-58	Me	Cl	CH ₂ (CH ₂) ₃ OC(CH ₃) ₃	N
IV-59	Me	CONH ₂	Pr-n	N
IV-60	Me	CONH ₂	Bu-n	N
IV-61	Me	CONH ₂	Bu-i	N
IV-62	Me	CONH ₂	Bu-t	N
IV-63	Me	CONH ₂	Pen-i	N
IV-64	Me	CONH ₂	Pen-c	N
IV-65	Me	CONH ₂	CH ₂ Pr-c	N
IV-66	Me	CONH ₂	CH ₂ CH=CH ₂	N
IV-67	Me	CONH ₂	CH ₂ C≡CH	N

【表 38】

化合物編號	R ¹	X	R ²	W
IV-68	Me	CONH ₂	CH ₂ C≡CCH ₃	N
IV-69	Me	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	N
IV-70	Me	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N
IV-71	Me	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
IV-72	Me	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N
IV-73	Me	CONH ₂	CH ₂ (CH ₂) ₃ OC(CH ₃) ₃	N
IV-74	Me	CN	Pr-n	N
IV-75	Me	CN	Bu-n	N
IV-76	Me	CN	Bu-i	N
IV-77	Me	CN	Bu-t	N
IV-78	Me	CN	Pen-i	N
IV-79	Me	CN	Pen-c	N
IV-80	Me	CN	CH ₂ Pr-c	N
IV-81	Me	CN	CH ₂ CH=CH ₂	N
IV-82	Me	CN	CH ₂ C≡CH	N
IV-83	Me	CN	CH ₂ C≡CCH ₃	N
IV-84	Me	CN	CH ₂ CF ₃	N
IV-85	Me	CN	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N
IV-86	Me	CN	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	N
IV-87	Me	CN	CH ₂ CH ₂ CH ₂ OCH ₃	N
IV-88	Me	CN	CH ₂ (CH ₂) ₃ OC(CH ₃) ₃	N
IV-89	Et	CN	Pr-n	N
IV-90	Pr-n	CN	Pr-n	N
IV-91	Bu-n	CN	Pr-n	N
IV-92	Bu-i	CN	Pr-n	N
IV-93	Bu-s	CN	Pr-n	N
IV-94	Bu-t	CN	Pr-n	N
IV-95	CH ₂ Pr-c	CN	Pr-n	N
IV-96	CH ₂ CH=CH ₂	CN	Pr-n	N
IV-97	CH ₂ C≡CH	CN	Pr-n	N
IV-98	CH ₂ CF ₃	CN	Pr-n	N
IV-99	CH ₂ Ph	CN	Pr-n	N
IV-100	Et	CONH ₂	Pr-n	N
IV-101	Pr-n	CONH ₂	Pr-n	N
IV-102	Bu-n	CONH ₂	Pr-n	N
IV-103	Bu-i	CONH ₂	Pr-n	N

【表 39】

化合物編號	R ¹	X	R ²	W
IV-104	Bu-s	CONH ₂	Pr-n	N
IV-105	Bu-t	CONH ₂	Pr-n	N
IV-106	CH ₂ Pr-c	CONH ₂	Pr-n	N
IV-107	CH ₂ CH=CH ₂	CONH ₂	Pr-n	N
IV-108	CH ₂ C≡CH	CONH ₂	Pr-n	N
IV-109	CH ₂ CF ₃	CONH ₂	Pr-n	N
IV-110	CH ₂ Ph	CONH ₂	Pr-n	N
IV-111	Bu-i	CN	Bu-i	N
IV-112	Bu-i	CONH ₂	Bu-i	N
IV-113	Pr-i	CN	CH ₂ CN	N
IV-114	Pr-i	CONH ₂	CH ₂ CN	N
IV-115	Bu-s	CN	Bu-s	N
IV-116	Bu-s	CONH ₂	Bu-s	N
IV-117	CH ₂ Pr-c	CN	CH ₂ Pr-c	N
IV-118	CH ₂ Pr-c	CONH ₂	CH ₂ Pr-c	N
IV-119	Pen-c	CN	Pen-c	N
IV-120	Pen-c	CONH ₂	Pen-c	N
IV-121	Me	CN	CH ₂ Ph	N
IV-122	Me	CONH ₂	CH ₂ Ph	N
IV-123	Pr-i	Cl	Bu-i	CH
IV-124	Pr-i	Cl	CH ₂ Pr-c	CH
IV-125	Pr-i	Me	Bu-i	CH
IV-126	Pr-i	Me	CH ₂ Pr-c	CH
IV-127	Me	CN	Pen-c	CH
IV-128	Me	CONH ₂	Pen-c	CH
IV-129	Pr-i	CN	Bu-i	CH
IV-130	Pr-i	CN	CH ₂ Pr-c	CH
IV-131	Pr-i	CN	Pen-i	CH
IV-132	Pr-i	CONH ₂	Bu-i	CH
IV-133	Pr-i	CONH ₂	CH ₂ Pr-c	CH
IV-134	Pr-i	CONH ₂	Pen-i	CH
IV-135	Pr-i	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	CH
IV-136	CH ₂ CF ₃	CONH ₂	Bu-i	CH
IV-137	CH ₂ CF ₃	CONH ₂	CH ₂ Pr-c	CH
IV-138	Bu-i	CONH ₂	Bu-i	CH
IV-139	Bu-i	CONH ₂	CH ₂ Pr-c	CH
IV-140	CH ₂ Pr-c	CONH ₂	Bu-i	CH

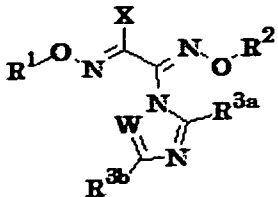
【表 40】

化合物編號	R ¹	X	R ²	W
IV-141	CH ₂ Pr-c	CONH ₂	CH ₂ Pr-c	CH
IV-142	Me	Cl	Bu-i	CH
IV-143	Me	Cl	CH ₂ Pr-c	CH
IV-144	Me	Me	Bu-i	CH
IV-145	Me	Me	CH ₂ Pr-c	CH
IV-146	Me	CN	Bu-i	CH
IV-147	Me	CN	CH ₂ Pr-c	CH
IV-148	Me	CN	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH
IV-149	Me	CN	Pen-i	CH
IV-150	Me	CONH ₂	Bu-i	CH
IV-151	Me	CONH ₂	CH ₂ Pr-c	CH
IV-152	Me	CONH ₂	Pen-i	CH
IV-153	Me	CONH ₂	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH
IV-154	Me	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	CH
IV-155	Me	CN	CH ₂ Ph	CH
IV-156	Me	CONH ₂	CH ₂ Ph	CH
IV-157	Me	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	CH
IV-158	Pri	CN	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	N
IV-159	Pri	CONH ₂	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	N
IV-160	Pri	Me	CH ₂ CH ₂ SCH ₃	N
IV-161	Pri	Me	CH ₂ CH ₂ SOCH ₃	N
IV-162	Pri	Me	CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃	N
IV-163	Pri	Me	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	N
IV-164	Pen-c	CN	Pr-n	N
IV-165	Pen-c	CONH ₂	Pr-n	N
IV-166	Pen-3	CN	Pr-n	N
IV-167	Pen-3	CONH ₂	Pr-n	N
IV-168	Et	CN	Bu-t	N
IV-169	Et	CONH ₂	Bu-t	N
IV-170	Pr-n	CN	Bu-t	N
IV-171	Pr-n	CONH ₂	Bu-t	N
IV-172	Pri	CN	Pen-2	N
IV-173	Pri	CONH ₂	Pen-2	N
IV-174	Pri	CN	Pen-3	N
IV-175	Pri	CONH ₂	Pen-3	N
IV-176	Pen-neo	CN	Pr-n	N
IV-177	Pen-neo	CONH ₂	Pr-n	N
IV-178	Pen-i	CN	Pr-n	N

【表 41】

化合物編號	R ¹	X	R ²	W
IV-179	Pen-i	CONH ₂	Pr-n	N
IV-180	CH ₂ Pr-c	CONH ₂	CHF ₂	N
IV-181	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CN	Pr-n	N
IV-182	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CONH ₂	Pr-n	N
IV-183	CH ₂ Ph	CN	CH ₂ CF ₃	N
IV-184	CH ₂ Ph	CN	CH ₂ CF ₃	CH
IV-185	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CN	CH ₂ CF ₃	CH
IV-186	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CONH ₂	CH ₂ CF ₃	CH
IV-187	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CN	CH ₂ CF ₃	N

【表 42】

						
化合物編號	R ¹	X	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	W
V-1	Pri	Cl	Pri	SH	H	N
V-2	Pri	Cl	Pri	SMe	H	N
V-3	Pri	Cl	Pri	SOMe	H	N
V-4	Pri	Cl	Pri	SH	H	CH
V-5	Pri	Cl	Pri	SMe	H	CH
V-6	Pri	Cl	Pri	SOMe	H	CH
V-7	Pri	Me	Pri	SH	H	N
V-8	Pri	Me	Pri	SMe	H	N
V-9	Pri	Me	Pri	SOMe	H	N
V-10	Pri	Me	Pri	SH	H	CH
V-11	Pri	Me	Pri	SMe	H	CH
V-12	Pri	Me	Pri	SOMe	H	CH
V-13	Pri	CN	Pri	SH	H	N
V-14	Pri	CN	Pri	SMe	H	N
V-15	Pri	CN	Pri	SOMe	H	N
V-16	Pri	CN	Pri	SH	H	CH
V-17	Pri	CN	Pri	SMe	H	CH
V-18	Pri	CN	Pri	SOMe	H	CH
V-19	Pri	CONH ₂	Pri	SH	H	N
V-20	Pri	CONH ₂	Pri	SMe	H	N
V-21	Pri	CONH ₂	Pri	SOMe	H	N
V-22	Pri	CONH ₂	Pri	SH	H	CH
V-23	Pri	CONH ₂	Pri	SMe	H	CH
V-24	Pri	CONH ₂	Pri	SOMe	H	CH
V-25	Pri	CF ₃	Pri	SH	H	N
V-26	Pri	CF ₃	Pri	SMe	H	N
V-27	Pri	CF ₃	Pri	SOMe	H	N
V-28	Pri	CF ₃	Pri	SH	H	CH
V-29	Pri	CF ₃	Pri	SMe	H	CH
V-30	Pri	CF ₃	Pri	SOMe	H	CH

【表 43】

化合物編號	R ¹	X	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	W
V-31	Pri	Cl	Et	SH	H	N
V-32	Pri	Cl	Et	SMe	H	N
V-33	Pri	Cl	Et	SOMe	H	N
V-34	Pri	Cl	Et	SH	H	CH
V-35	Pri	Cl	Et	SMe	H	CH
V-36	Pri	Cl	Et	SOMe	H	CH
V-37	Pri	Me	Et	SH	H	N
V-38	Pri	Me	Et	SMe	H	N
V-39	Pri	Me	Et	SOMe	H	N
V-40	Pri	Me	Et	SH	H	CH
V-41	Pri	Me	Et	SMe	H	CH
V-42	Pri	Me	Et	SOMe	H	CH
V-43	Pri	CN	Et	SH	H	N
V-44	Pri	CN	Et	SMe	H	N
V-45	Pri	CN	Et	SOMe	H	N
V-46	Pri	CN	Et	SH	H	CH
V-47	Pri	CN	Et	SMe	H	CH
V-48	Pri	CN	Et	SOMe	H	CH
V-49	Pri	CONH ₂	Et	SH	H	N
V-50	Pri	CONH ₂	Et	SMe	H	N
V-51	Pri	CONH ₂	Et	SOMe	H	N
V-52	Pri	CONH ₂	Et	SH	H	CH
V-53	Pri	CONH ₂	Et	SMe	H	CH
V-54	Pri	CONH ₂	Et	SOMe	H	CH
V-55	Pri	CF ₃	Et	SH	H	N
V-56	Pri	CF ₃	Et	SMe	H	N
V-57	Pri	CF ₃	Et	SOMe	H	N
V-58	Pri	CF ₃	Et	SH	H	CH
V-59	Pri	CF ₃	Et	SMe	H	CH
V-60	Pri	CF ₃	Et	SOMe	H	CH
V-61	Pri	Cl	Me	SH	H	N
V-62	Pri	Cl	Me	SMe	H	N
V-63	Pri	Cl	Me	SOMe	H	N
V-64	Pri	Cl	Me	SH	H	CH
V-65	Pri	Cl	Me	SMe	H	CH
V-66	Pri	Cl	Me	SOMe	H	CH

【表 44】

化合物編號	R ¹	X	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	W
V-67	Pr-i	Me	Me	SH	H	N
V-68	Pr-i	Me	Me	SMe	H	N
V-69	Pr-i	Me	Me	SOMe	H	N
V-70	Pr-i	Me	Me	SH	H	CH
V-71	Pr-i	Me	Me	SMe	H	CH
V-72	Pr-i	Me	Me	SOMe	H	CH
V-73	Pr-i	CN	Me	SH	H	N
V-74	Pr-i	CN	Me	SMe	H	N
V-75	Pr-i	CN	Me	SOMe	H	N
V-76	Pr-i	CN	Me	SH	H	CH
V-77	Pr-i	CN	Me	SMe	H	CH
V-78	Pr-i	CN	Me	SOMe	H	CH
V-79	Pr-i	CONH ₂	Me	SH	H	N
V-80	Pr-i	CONH ₂	Me	SMe	H	N
V-81	Pr-i	CONH ₂	Me	SOMe	H	N
V-82	Pr-i	CONH ₂	Me	SH	H	CH
V-83	Pr-i	CONH ₂	Me	SMe	H	CH
V-84	Pr-i	CONH ₂	Me	SOMe	H	CH
V-85	Pr-i	CF ₃	Me	SH	H	N
V-86	Pr-i	CF ₃	Me	SMe	H	N
V-87	Pr-i	CF ₃	Me	SOMe	H	N
V-88	Pr-i	CF ₃	Me	SH	H	CH
V-89	Pr-i	CF ₃	Me	SMe	H	CH
V-90	Pr-i	CF ₃	Me	SOMe	H	CH
V-91	Bu-i	Cl	Pr-i	SH	H	N
V-92	Bu-i	Cl	Pr-i	SMe	H	N
V-93	Bu-i	Cl	Pr-i	SOMe	H	N
V-94	Bu-i	Cl	Pr-i	SH	H	CH
V-95	Bu-i	Cl	Pr-i	SMe	H	CH
V-96	Bu-i	Cl	Pr-i	SOMe	H	CH
V-97	Bu-i	Me	Pr-i	SH	H	N
V-98	Bu-i	Me	Pr-i	SMe	H	N
V-99	Bu-i	Me	Pr-i	SOMe	H	N
V-100	Bu-i	Me	Pr-i	SH	H	CH
V-101	Bu-i	Me	Pr-i	SMe	H	CH
V-102	Bu-i	Me	Pr-i	SOMe	H	CH

【表 45】

化合物編號	R ¹	X	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	W
V-103	Bu-i	CN	Pr-i	SH	H	N
V-104	Bu-i	CN	Pr-i	SMe	H	N
V-105	Bu-i	CN	Pr-i	SOMe	H	N
V-106	Bu-i	CN	Pr-i	SH	H	CH
V-107	Bu-i	CN	Pr-i	SMe	H	CH
V-108	Bu-i	CN	Pr-i	SOMe	H	CH
V-109	Bu-i	CONH ₂	Pr-i	SH	H	N
V-110	Bu-i	CONH ₂	Pr-i	SMe	H	N
V-111	Bu-i	CONH ₂	Pr-i	SOMe	H	N
V-112	Bu-i	CONH ₂	Pr-i	SH	H	CH
V-113	Bu-i	CONH ₂	Pr-i	SMe	H	CH
V-114	Bu-i	CONH ₂	Pr-i	SOMe	H	CH
V-115	Bu-i	CF ₃	Pr-i	SH	H	N
V-116	Bu-i	CF ₃	Pr-i	SMe	H	N
V-117	Bu-i	CF ₃	Pr-i	SOMe	H	N
V-118	Bu-i	CF ₃	Pr-i	SH	H	CH
V-119	Bu-i	CF ₃	Pr-i	SMe	H	CH
V-120	Bu-i	CF ₃	Pr-i	SOMe	H	CH
V-121	Bu-i	Cl	Et	SH	H	N
V-122	Bu-i	Cl	Et	SMe	H	N
V-123	Bu-i	Cl	Et	SOMe	H	N
V-124	Bu-i	Cl	Et	SH	H	CH
V-125	Bu-i	Cl	Et	SMe	H	CH
V-126	Bu-i	Cl	Et	SOMe	H	CH
V-127	Bu-i	Me	Et	SH	H	N
V-128	Bu-i	Me	Et	SMe	H	N
V-129	Bu-i	Me	Et	SOMe	H	N
V-130	Bu-i	Me	Et	SH	H	CH
V-131	Bu-i	Me	Et	SMe	H	CH
V-132	Bu-i	Me	Et	SOMe	H	CH
V-133	Bu-i	CN	Et	SH	H	N
V-134	Bu-i	CN	Et	SMe	H	N
V-135	Bu-i	CN	Et	SOMe	H	N
V-136	Bu-i	CN	Et	SH	H	CH
V-137	Bu-i	CN	Et	SMe	H	CH
V-138	Bu-i	CN	Et	SOMe	H	CH

【表 46】

化合物編號	R ¹	X	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	W
V-139	Bu-i	CONH ₂	Et	SH	H	N
V-140	Bu-i	CONH ₂	Et	SMe	H	N
V-141	Bu-i	CONH ₂	Et	SOMe	H	N
V-142	Bu-i	CONH ₂	Et	SH	H	CH
V-143	Bu-i	CONH ₂	Et	SMe	H	CH
V-144	Bu-i	CONH ₂	Et	SOMe	H	CH
V-145	Bu-i	CF ₃	Et	SH	H	N
V-146	Bu-i	CF ₃	Et	SMe	H	N
V-147	Bu-i	CF ₃	Et	SOMe	H	N
V-148	Bu-i	CF ₃	Et	SH	H	CH
V-149	Bu-i	CF ₃	Et	SMe	H	CH
V-150	Bu-i	CF ₃	Et	SOMe	H	CH
V-151	Bu-i	Cl	Me	SH	H	N
V-152	Bu-i	Cl	Me	SMe	H	N
V-153	Bu-i	Cl	Me	SOMe	H	N
V-154	Bu-i	Cl	Me	SH	H	CH
V-155	Bu-i	Cl	Me	SMe	H	CH
V-156	Bu-i	Cl	Me	SOMe	H	CH
V-157	Bu-i	Me	Me	SH	H	N
V-158	Bu-i	Me	Me	SMe	H	N
V-159	Bu-i	Me	Me	SOMe	H	N
V-160	Bu-i	Me	Me	SH	H	CH
V-161	Bu-i	Me	Me	SMe	H	CH
V-162	Bu-i	Me	Me	SOMe	H	CH
V-163	Bu-i	CN	Me	SH	H	N
V-164	Bu-i	CN	Me	SMe	H	N
V-165	Bu-i	CN	Me	SOMe	H	N
V-166	Bu-i	CN	Me	SH	H	CH
V-167	Bu-i	CN	Me	SMe	H	CH
V-168	Bu-i	CN	Me	SOMe	H	CH
V-169	Bu-i	CONH ₂	Me	SH	H	N
V-170	Bu-i	CONH ₂	Me	SMe	H	N
V-171	Bu-i	CONH ₂	Me	SOMe	H	N
V-172	Bu-i	CONH ₂	Me	SH	H	CH
V-173	Bu-i	CONH ₂	Me	SMe	H	CH
V-174	Bu-i	CONH ₂	Me	SOMe	H	CH

【表 47】

化合物編號	R ¹	X	R ²	R ^{3a}	R ^{3b}	W
V-175	Bu-i	CF ₃	Me	SH	H	N
V-176	Bu-i	CF ₃	Me	SMe	H	N
V-177	Bu-i	CF ₃	Me	SOMe	H	N
V-178	Bu-i	CF ₃	Me	SH	H	CH
V-179	Bu-i	CF ₃	Me	SMe	H	CH
V-180	Bu-i	CF ₃	Me	SOMe	H	CH
V-181	Et	CN	Et	H	CF ₃	N
V-182	Et	CONH ₂	Et	H	CF ₃	N
V-183	Bu-i	Me	Et	CHO	H	N
V-184	Bu-i	Me	Et	CH=NOH	H	N
V-185	Bu-i	Me	Et	CN	H	N
V-186	Pr-i	Me	Et	H	NO ₂	N
V-187	Pr-i	Me	Et	Cl	H	N
V-188	Pr-i	Me	Et	H	Me	N
V-189	Pr-i	Me	Et	OH	H	N
V-190	Pr-i	Me	Et	OCH ₃	H	N
V-191	Pr-i	CF ₃	Me	SO ₂ Me	H	CH

【表 48】

$\begin{array}{c} \text{X} \\ \\ \text{R}^1\text{-O}-\text{N}=\text{C}-\text{C}=\text{N}-\text{O}-\text{R}^2 \\ \\ \text{Q} \end{array}$				
化合物編號	R ¹	X	R ²	Q
VI-1	Me	Cl	Pri	Cl
VI-2	Et	Cl	Pri	Cl
VI-3	Pr-n	Cl	Pri	Cl
VI-4	Pri	Cl	Pri	Cl
VI-5	Bu-n	Cl	Pri	Cl
VI-6	Bu-i	Cl	Pri	Cl
VI-7	Bu-s	Cl	Pri	Cl
VI-8	But	Cl	Pri	Cl
VI-9	Pen-n	Cl	Pri	Cl
VI-10	Pen-i	Cl	Pri	Cl
VI-11	Pen-neo	Cl	Pri	Cl
VI-12	Pen-2	Cl	Pri	Cl
VI-13	Pen-3	Cl	Pri	Cl
VI-14	Hex-n	Cl	Pri	Cl
VI-15	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Cl	Pri	Cl
VI-16	Pen-c	Cl	Pri	Cl
VI-17	Hex-c	Cl	Pri	Cl
VI-18	CH ₂ Pr-c	Cl	Pri	Cl
VI-19	CH ₂ Bu-c	Cl	Pri	Cl
VI-20	CH ₂ Pen-c	Cl	Pri	Cl
VI-21	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	Pri	Cl
VI-22	CH ₂ C≡CH	Cl	Pri	Cl
VI-23	CH ₂ C≡CCH ₃	Cl	Pri	Cl
VI-24	Me	CN	Pri	Cl
VI-25	Et	CN	Pri	Cl
VI-26	Pr-n	CN	Pri	Cl
VI-27	Pri	CN	Pri	Cl
VI-28	Bu-n	CN	Pri	Cl
VI-29	Bu-i	CN	Pri	Cl
VI-30	Bu-s	CN	Pri	Cl
VI-31	But	CN	Pri	Cl
VI-32	Pen-n	CN	Pri	Cl

【表 49】

化合物編號	R ¹	X	R ²	Q
VI-33	Pen-i	CN	Pr-i	Cl
VI-34	Pen-neo	CN	Pr-i	Cl
VI-35	Pen-2	CN	Pr-i	Cl
VI-36	Pen-3	CN	Pr-i	Cl
VI-37	Hex-n	CN	Pr-i	Cl
VI-38	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CN	Pr-i	Cl
VI-39	Pen-c	CN	Pr-i	Cl
VI-40	Hex-c	CN	Pr-i	Cl
VI-41	CH ₂ Pr-c	CN	Pr-i	Cl
VI-42	CH ₂ Bu-c	CN	Pr-i	Cl
VI-43	CH ₂ Pen-c	CN	Pr-i	Cl
VI-44	CH ₂ CH=CH ₂	CN	Pr-i	Cl
VI-45	CH ₂ C≡CH	CN	Pr-i	Cl
VI-46	CH ₂ C≡CCH ₃	CN	Pr-i	Cl
VI-47	CH ₂ CF ₃	CN	Pr-i	Cl
VI-48	Me	Me	Pr-i	Cl
VI-49	Et	Me	Pr-i	Cl
VI-50	Pr-n	Me	Pr-i	Cl
VI-51	Pr-i	Me	Pr-i	Cl
VI-52	Bu-n	Me	Pr-i	Cl
VI-53	Bu-i	Me	Pr-i	Cl
VI-54	Bu-s	Me	Pr-i	Cl
VI-55	Bu-t	Me	Pr-i	Cl
VI-56	Pen-n	Me	Pr-i	Cl
VI-57	Pen-i	Me	Pr-i	Cl
VI-58	Pen-neo	Me	Pr-i	Cl
VI-59	Pen-2	Me	Pr-i	Cl
VI-60	Pen-3	Me	Pr-i	Cl
VI-61	Hex-n	Me	Pr-i	Cl
VI-62	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	Pr-i	Cl
VI-63	CH ₂ Pr-c	Me	Pr-i	Cl
VI-64	CH ₂ Bu-c	Me	Pr-i	Cl
VI-65	CH ₂ Pen-c	Me	Pr-i	Cl
VI-66	Me	Cl	Et	Cl
VI-67	Et	Cl	Et	Cl
VI-68	Pr-n	Cl	Et	Cl

【表 50】

化合物編號	R ¹	X	R ²	Q
VI-69	Pr-i	Cl	Et	Cl
VI-70	Bu-n	Cl	Et	Cl
VI-71	Bu-i	Cl	Et	Cl
VI-72	Bu-s	Cl	Et	Cl
VI-73	Bu-t	Cl	Et	Cl
VI-74	Pen-n	Cl	Et	Cl
VI-75	Pen-i	Cl	Et	Cl
VI-76	Pen-neo	Cl	Et	Cl
VI-77	Pen-2	Cl	Et	Cl
VI-78	Pen-3	Cl	Et	Cl
VI-79	Hex-n	Cl	Et	Cl
VI-80	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Cl	Et	Cl
VI-81	Pen-c	Cl	Et	Cl
VI-82	Hex-c	Cl	Et	Cl
VI-83	CH ₂ Pr-c	Cl	Et	Cl
VI-84	CH ₂ Bu-c	Cl	Et	Cl
VI-85	CH ₂ Pen-c	Cl	Et	Cl
VI-86	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	Et	Cl
VI-87	CH ₂ C≡CH	Cl	Et	Cl
VI-88	CH ₂ C≡CCH ₃	Cl	Et	Cl
VI-89	Me	CN	Et	Cl
VI-90	Et	CN	Et	Cl
VI-91	Pr-n	CN	Et	Cl
VI-92	Pr-i	CN	Et	Cl
VI-93	Bu-n	CN	Et	Cl
VI-94	Bu-i	CN	Et	Cl
VI-95	Bu-s	CN	Et	Cl
VI-96	Bu-t	CN	Et	Cl
VI-97	Pen-n	CN	Et	Cl
VI-98	Pen-i	CN	Et	Cl
VI-99	Pen-neo	CN	Et	Cl
VI-100	Pen-2	CN	Et	Cl
VI-101	Pen-3	CN	Et	Cl
VI-102	Hex-n	CN	Et	Cl
VI-103	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CN	Et	Cl
VI-104	Pen-c	CN	Et	Cl

【表 51】

化合物編號	R ¹	X	R ²	Q
VI-105	Hex-c	CN	Et	Cl
VI-106	CH ₂ Pr-c	CN	Et	Cl
VI-107	CH ₂ Bu-c	CN	Et	Cl
VI-108	CH ₂ Pen-c	CN	Et	Cl
VI-109	CH ₂ CH=CH ₂	CN	Et	Cl
VI-110	CH ₂ C≡CH	CN	Et	Cl
VI-111	CH ₂ C≡CCH ₃	CN	Et	Cl
VI-112	Me	Me	Et	Cl
VI-113	Et	Me	Et	Cl
VI-114	Pr-n	Me	Et	Cl
VI-115	Pr-i	Me	Et	Cl
VI-116	Bu-n	Me	Et	Cl
VI-117	Bu-i	Me	Et	Cl
VI-118	Bu-s	Me	Et	Cl
VI-119	Bu-t	Me	Et	Cl
VI-120	Pen-n	Me	Et	Cl
VI-121	Pen-i	Me	Et	Cl
VI-122	Pen-neo	Me	Et	Cl
VI-123	Pen-2	Me	Et	Cl
VI-124	Pen-3	Me	Et	Cl
VI-125	Hex-n	Me	Et	Cl
VI-126	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	Et	Cl
VI-127	CH ₂ Pr-c	Me	Et	Cl
VI-128	CH ₂ Bu-c	Me	Et	Cl
VI-129	CH ₂ Pen-c	Me	Et	Cl
VI-130	Me	Cl	Me	Cl
VI-131	Et	Cl	Me	Cl
VI-132	Pr-n	Cl	Me	Cl
VI-133	Pr-i	Cl	Me	Cl
VI-134	Bu-n	Cl	Me	Cl
VI-135	Bu-i	Cl	Me	Cl
VI-136	Bu-s	Cl	Me	Cl
VI-137	Bu-t	Cl	Me	Cl
VI-138	Pen-n	Cl	Me	Cl
VI-139	Pen-i	Cl	Me	Cl
VI-140	Pen-neo	Cl	Me	Cl

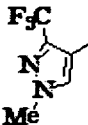
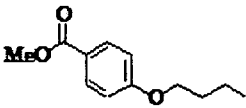
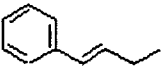
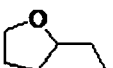
【表 52】

化合物編號	R ¹	X	R ²	Q
VI-141	Pen-2	Cl	Me	Cl
VI-142	Pen-3	Cl	Me	Cl
VI-143	Hex-n	Cl	Me	Cl
VI-144	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Cl	Me	Cl
VI-145	Pen-c	Cl	Me	Cl
VI-146	Hex-c	Cl	Me	Cl
VI-147	CH ₂ Pr-c	Cl	Me	Cl
VI-148	CH ₂ Bu-c	Cl	Me	Cl
VI-149	CH ₂ Pen-c	Cl	Me	Cl
VI-150	CH ₂ CH=CH ₂	Cl	Me	Cl
VI-151	CH ₂ C≡CH	Cl	Me	Cl
VI-152	CH ₂ C≡CCH ₃	Cl	Me	Cl
VI-153	Me	CN	Me	Cl
VI-154	Et	CN	Me	Cl
VI-155	Pr-n	CN	Me	Cl
VI-156	Pr-i	CN	Me	Cl
VI-157	Bu-n	CN	Me	Cl
VI-158	Bu-i	CN	Me	Cl
VI-159	Bu-s	CN	Me	Cl
VI-160	Bu-t	CN	Me	Cl
VI-161	Pen-n	CN	Me	Cl
VI-162	Pen-i	CN	Me	Cl
VI-163	Pen-neo	CN	Me	Cl
VI-164	Pen-2	CN	Me	Cl
VI-165	Pen-3	CN	Me	Cl
VI-166	Hex-n	CN	Me	Cl
VI-167	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CN	Me	Cl
VI-168	Pen-c	CN	Me	Cl
VI-169	Hex-c	CN	Me	Cl
VI-170	CH ₂ Pr-c	CN	Me	Cl
VI-171	CH ₂ Bu-c	CN	Me	Cl
VI-172	CH ₂ Pen-c	CN	Me	Cl
VI-173	CH ₂ CH=CH ₂	CN	Me	Cl
VI-174	CH ₂ C≡CH	CN	Me	Cl
VI-175	CH ₂ C≡CCH ₃	CN	Me	Cl
VI-176	Me	Me	Me	Cl

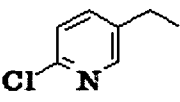
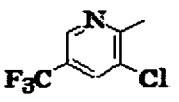
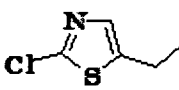
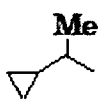
【表 53】

化合物編號	R ¹	X	R ²	Q
VI-177	Et	Me	Me	Cl
VI-178	Pr-n	Me	Me	Cl
VI-179	Pr-i	Me	Me	Cl
VI-180	Bu-n	Me	Me	Cl
VI-181	Bu-i	Me	Me	Cl
VI-182	Bu-s	Me	Me	Cl
VI-183	Bu-t	Me	Me	Cl
VI-184	Pen-n	Me	Me	Cl
VI-185	Pen-i	Me	Me	Cl
VI-186	Pen-neo	Me	Me	Cl
VI-187	Pen-2	Me	Me	Cl
VI-188	Pen-3	Me	Me	Cl
VI-189	Hex-n	Me	Me	Cl
VI-190	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	Me	Me	Cl
VI-191	CH ₂ Pr-c	Me	Me	Cl
VI-192	CH ₂ Bu-c	Me	Me	Cl
VI-193	CH ₂ Pen-c	Me	Me	Cl
VI-194	Me	CN	Pr-n	Cl
VI-195	Et	CN	Pr-n	Cl
VI-196	Pr-i	CN	Pr-n	Cl
VI-197	Bu-n	CN	Pr-n	Cl
VI-198	Bu-i	CN	Pr-n	Cl
VI-199	Bu-s	CN	Pr-n	Cl
VI-200	CH ₂ Pr-c	CN	Pr-n	Cl
VI-201	CH ₂ CH=CH ₂	CN	Pr-n	Cl
VI-202	CH ₂ C≡CH	CN	Pr-n	Cl
VI-203	CH ₂ CF ₃	CN	Pr-n	Cl
VI-204	Me	CN	Bu-i	Cl
VI-205	Me	CN	Pen-i	Cl
VI-206	Me	CN	CH ₂ Pr-c	Cl
VI-207	Me	CN	Pen-c	Cl
VI-208	Me	CN	CH ₂ Ph	Cl
VI-209	Me	CN	CH ₂ CH ₂ OEt	Cl
VI-210	Pr-i	CN	CH ₂ CH=CH ₂	Cl
VI-211	Pr-i	CN	CH ₂ C≡CH	Cl
VI-212	Pr-i	CN	CH ₂ CF ₃	Cl

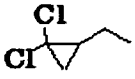
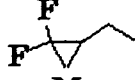
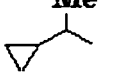
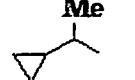
【表 54】

化合物編號	R ¹	X	R ²	Q
VI-213	Pr-i	CN	CH ₂ CH ₂ OEt	Cl
VI-214	CH ₂ Pr-c	CN	CH ₂ Pr-c	Cl
VI-215	CH ₂ Ph	CN	Pr-i	Cl
VI-216	Pr-i	CONH ₂	Bu-i	Cl
VI-217	Pr-i	CN	Bu-t	Cl
VI-218	Pr-i	CN	Bu-s	Cl
VI-219	Pr-i	CN	CH ₂ CN	Cl
VI-220	Bu-t	CONHBu-t	Me	Cl
VI-221	Pr-i	CO ₂ Me	Pr-i	Cl
VI-222	Me		Et	Cl
VI-223	Me		Et	Cl
VI-224	Pr-i		Pr-i	Cl
VI-225	Pr-i		Pr-i	Cl
VI-226	Et		Et	Cl
VI-227	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	CN	Et	Cl
VI-228		CN	Me	Cl
VI-229		CN	Me	Cl
VI-230		CN	Me	Cl
VI-231		CN	Me	Cl
VI-232	CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CN	Et	Cl
VI-233	CH ₂ C(Cl)=CH ₂	CN	Pr-i	Cl
VI-234	CH ₂ C(Cl)=CHCl	CN	Pr-i	Cl

【表 55】

化合物編號	R ¹	X	R ²	Q
VI-235	$\text{CH}_2\text{C}(\text{CH}_3)=\text{CH}_2$	CN	Pr-i	Cl
VI-236		CN	Pr-i	Cl
VI-237		CN	Pr-i	Cl
VI-238	$\text{CH}_2\text{Ph}(3\text{-CF}_3)$	CN	Pr-i	Cl
VI-239	$\text{CH}_2\text{Ph}(4\text{-CF}_3)$	CN	Pr-i	Cl
VI-240	$\text{CH}_2\text{Ph}(4\text{-OCH}_3)$	CN	Pr-i	Cl
VI-241	$\text{CH}_2\text{Ph}(4\text{-CN})$	CN	Pr-i	Cl
VI-242	$\text{CH}_2\text{Ph}(4\text{-Cl})$	CN	Pr-i	Cl
VI-243	$\text{CH}_2\text{Ph}(4\text{-CH}_3)$	CN	Pr-i	Cl
VI-244	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	CN	Pr-i	Cl
VI-245	$\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Ph}$	CN	Pr-i	Cl
VI-246	$\text{CH}(\text{CH}_3)\text{Ph}$	CN	Pr-i	Cl
VI-247	Bu-c	CN	Pr-i	Cl
VI-248	$\text{CH}_2\text{Si}(\text{CH}_3)_3$	CN	Pr-i	Cl
VI-249		CN	Pr-i	Cl
VI-250		CN	Pr-i	Cl
VI-251		CN	Me	Cl
VI-252		CN	Et	Cl
VI-253		CN	Pr-i	Cl
VI-254	Pr-i	CN	$\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_3$	Cl
VI-255	Pr-i	CN	Pen-2	Cl
VI-256	Pr-i	CN	Pen-3	Cl
VI-257	Pen-3	CN	Pr-n	Cl
VI-258	Pen-c	CN	Pr-n	Cl
VI-259	CH_2OCH_3	CN	Et	Cl
VI-260	$\text{CH}_2(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$	CN	Et	Cl

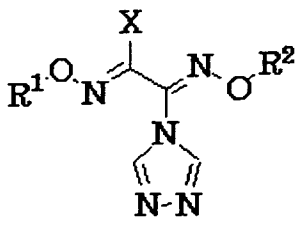
【表 56】

化合物編號	R ¹	X	R ²	Q
VI-261		CN	Et	Cl
VI-262		CN	Et	Cl
VI-263		CN	Me	Cl
VI-264		CN	Et	Cl
VI-265	CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	CN	Me	Cl
VI-266	Me	CN	Bu-t	Cl
VI-267	Et	CN	Bu-t	Cl
VI-268	Pr-n	CN	Bu-t	Cl
VI-269	Pr-i	CONH ₂	Pr-i	Cl
VI-270	CH ₂ Ph(3-CN)	CN	Pr-i	Cl
VI-271	CH ₂ Ph(3-OCH ₃)	CN	Pr-i	Cl
VI-272	CH ₂ (CH ₂) ₆ CH ₃	CN	Pr-i	Cl
VI-273	CH ₂ (CH ₂) ₈ CH ₃	CN	Pr-i	Cl
VI-274	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃	CN	Et	Cl
VI-275	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃	CN	Me	Cl
VI-276	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CN	Et	Cl
VI-277	CH ₂ Ph(4-F)	CN	Pr-i	Cl
VI-278	CH ₂ Ph(2-CF ₃)	CN	Pr-i	Cl
VI-279	CH ₂ Ph(2-CN)	CN	Pr-i	Cl
VI-280	CH ₂ Ph(4-CO ₂ CH ₂ CH ₃)	CN	Pr-i	Cl
VI-281	Pen-neo	CN	Pr-n	Cl
VI-282	Pen-i	CN	Pr-n	Cl
VI-283	CF ₂ CHF ₂	CN	Et	Cl
VI-284	CH ₂ CH=C(CH ₃) ₂	CN	Pr-i	Cl
VI-285	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CN	CN	Me	Cl
VI-286	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	CN	Me	Cl
VI-287	CH ₂ C(CH ₃) ₂ CH ₂ Cl	CN	Et	Cl
VI-288	CH ₂ (CF ₂) ₃ CHF ₂	CN	Me	Cl
VI-289	CH ₂ (CF ₂) ₂ CF ₃	CN	Me	Cl
VI-290	CH ₂ (CF ₂) ₃ CHF ₂	CN	Et	Cl

【表 57】

化合物編號	R ¹	X	R ²	Q
VI-291	CH ₂ (CH ₂) ₂ CF ₃	CN	Me	Cl
VI-292	CH ₂ (CH ₂) ₂ CF ₂ CF ₃	CN	Me	Cl
VI-293	CF ₂ CHF CF ₃	CN	Me	Cl
VI-294	CH ₂ CH ₂ CF ₃	CN	Me	Cl
VI-295		CN	Me	Cl
VI-296	CH(CH ₂ F) ₂	CN	Me	Cl
VI-297	CH ₂ Pr-c		Me	Cl
VI-298	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CN	Pr-n	Cl
VI-299	CH ₂ CF ₂ CF ₃	CN	Pr-i	Cl
VI-300	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CN	Pr-i	Cl
VI-301	CH ₂ CCH ₃ (CF ₃) ₂	CN	Me	Cl
VI-302	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CN	Me	Cl
VI-303	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CF ₃	CN	Me	Cl
VI-304	CH ₂ Ph	CN	CH ₂ CF ₃	Cl
VI-305		CN	Me	Cl
VI-306	CH ₂ Si(CH ₃) ₃	CN	Me	Cl
VI-307	CH(CH ₃)CF ₃	CN	Me	Cl
VI-308	Pr-n	CN	Pr-n	Cl
VI-309	CH(CH ₃)CF ₃	CN	Pr-i	Cl
VI-310	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CN	Me	Cl
VI-311	CH ₂ Ph(1,2,3,4,5-penta-F)	CN	Me	Cl
VI-312	CH ₂ Ph(3-F)	CN	Me	Cl
VI-313	CH ₂ Ph(4-F)	CN	Me	Cl
VI-314	CH ₂ CH ₂ OCH(CH ₃) ₂	CN	Pr-i	Cl
VI-315	CH ₂ Ph(2,6-di-CH ₃)	CN	Pr-i	Cl

【表 58】

			
化合物編號	R¹	X	R²
VII-1	Me	CN	Pr-i
VII-2	Et	CN	Pr-i
VII-3	Pr-n	CN	Pr-i
VII-4	Pr-i	CN	Pr-i
VII-5	Bu-n	CN	Pr-i
VII-6	Bu-i	CN	Pr-i
VII-7	Bu-s	CN	Pr-i
VII-8	Bu-t	CN	Pr-i
VII-9	Pen-n	CN	Pr-i
VII-10	Pen-i	CN	Pr-i
VII-11	Pen-neo	CN	Pr-i
VII-12	Pen-2	CN	Pr-i
VII-13	Pen-3	CN	Pr-i
VII-14	Hex-n	CN	Pr-i
VII-15	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CN	Pr-i
VII-16	Pen-c	CN	Pr-i
VII-17	Hex-c	CN	Pr-i
VII-18	CH ₂ Pr-c	CN	Pr-i
VII-19	CH ₂ Bu-c	CN	Pr-i
VII-20	CH ₂ Pen-c	CN	Pr-i
VII-21	CH ₂ CH=CH ₂	CN	Pr-i
VII-22	CH ₂ C≡CH	CN	Pr-i
VII-23	CH ₂ C≡CCH ₃	CN	Pr-i
VII-24	Me	CONH ₂	Pr-i
VII-25	Et	CONH ₂	Pr-i
VII-26	Pr-n	CONH ₂	Pr-i
VII-27	Pr-i	CONH ₂	Pr-i
VII-28	Bu-n	CONH ₂	Pr-i
VII-29	Bu-i	CONH ₂	Pr-i
VII-30	Bu-s	CONH ₂	Pr-i

【表 59】

化合物編號	R ¹	X	R ²
VII-31	Bu-t	CONH ₂	Pr-i
VII-32	Pen-n	CONH ₂	Pr-i
VII-33	Pen-i	CONH ₂	Pr-i
VII-34	Pen-neo	CONH ₂	Pr-i
VII-35	Pen-2	CONH ₂	Pr-i
VII-36	Pen-3	CONH ₂	Pr-i
VII-37	Hex-n	CONH ₂	Pr-i
VII-38	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CONH ₂	Pr-i
VII-39	Pen-c	CONH ₂	Pr-i
VII-40	Hex-c	CONH ₂	Pr-i
VII-41	CH ₂ Pr-c	CONH ₂	Pr-i
VII-42	CH ₂ Bu-c	CONH ₂	Pr-i
VII-43	CH ₂ Pen-c	CONH ₂	Pr-i
VII-44	CH ₂ CH=CH ₂	CONH ₂	Pr-i
VII-45	CH ₂ C≡CH	CONH ₂	Pr-i
VII-46	CH ₂ C≡CCH ₃	CONH ₂	Pr-i
VII-47	Me	CN	Et
VII-48	Et	CN	Et
VII-49	Pr-n	CN	Et
VII-50	Pr-i	CN	Et
VII-51	Bu-n	CN	Et
VII-52	Bu-i	CN	Et
VII-53	Bu-s	CN	Et
VII-54	Bu-t	CN	Et
VII-55	Pen-n	CN	Et
VII-56	Pen-i	CN	Et
VII-57	Pen-neo	CN	Et
VII-58	Pen-2	CN	Et
VII-59	Pen-3	CN	Et
VII-60	Hex-n	CN	Et
VII-61	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CN	Et
VII-62	Pen-c	CN	Et
VII-63	Hex-c	CN	Et
VII-64	CH ₂ Pr-c	CN	Et
VII-65	CH ₂ Bu-c	CN	Et
VII-66	CH ₂ Pen-c	CN	Et

【表 60】

化合物編號	R ¹	X	R ²
VII-67	CH ₂ CH=CH ₂	CN	Et
VII-68	CH ₂ C≡CH	CN	Et
VII-69	CH ₂ C≡CCH ₃	CN	Et
VII-70	Me	CONH ₂	Et
VII-71	Et	CONH ₂	Et
VII-72	Pr-n	CONH ₂	Et
VII-73	Pr-i	CONH ₂	Et
VII-74	Bu-n	CONH ₂	Et
VII-75	Bu-i	CONH ₂	Et
VII-76	Bu-s	CONH ₂	Et
VII-77	Bu-t	CONH ₂	Et
VII-78	Pen-n	CONH ₂	Et
VII-79	Pen-i	CONH ₂	Et
VII-80	Pen-neo	CONH ₂	Et
VII-81	Pen-2	CONH ₂	Et
VII-82	Pen-3	CONH ₂	Et
VII-83	Hex-n	CONH ₂	Et
VII-84	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CONH ₂	Et
VII-85	Pen-c	CONH ₂	Et
VII-86	Hex-c	CONH ₂	Et
VII-87	CH ₂ Pr-c	CONH ₂	Et
VII-88	CH ₂ Bu-c	CONH ₂	Et
VII-89	CH ₂ Pen-c	CONH ₂	Et
VII-90	CH ₂ CH=CH ₂	CONH ₂	Et
VII-91	CH ₂ C≡CH	CONH ₂	Et
VII-92	CH ₂ C≡CCH ₃	CONH ₂	Et
VII-93	Me	CN	Me
VII-94	Et	CN	Me
VII-95	Pr-n	CN	Me
VII-96	Pr-i	CN	Me
VII-97	Bu-n	CN	Me
VII-98	Bu-i	CN	Me
VII-99	Bu-s	CN	Me
VII-100	Bu-t	CN	Me
VII-101	Pen-n	CN	Me
VII-102	Pen-i	CN	Me

【表 61】

化合物編號	R ¹	X	R ²
VII-103	Pen-neo	CN	Me
VII-104	Pen-2	CN	Me
VII-105	Pen-3	CN	Me
VII-106	Hex-n	CN	Me
VII-107	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CN	Me
VII-108	Pen-c	CN	Me
VII-109	Hex-c	CN	Me
VII-110	CH ₂ Pr-c	CN	Me
VII-111	CH ₂ Bu-c	CN	Me
VII-112	CH ₂ Pen-c	CN	Me
VII-113	CH ₂ CH=CH ₂	CN	Me
VII-114	CH ₂ C≡CH	CN	Me
VII-115	CH ₂ C≡CCH ₃	CN	Me
VII-116	Me	CONH ₂	Me
VII-117	Et	CONH ₂	Me
VII-118	Pr-n	CONH ₂	Me
VII-119	Pr-i	CONH ₂	Me
VII-120	Bu-n	CONH ₂	Me
VII-121	Bu-i	CONH ₂	Me
VII-122	Bu-s	CONH ₂	Me
VII-123	Bu-t	CONH ₂	Me
VII-124	Pen-n	CONH ₂	Me
VII-125	Pen-i	CONH ₂	Me
VII-126	Pen-neo	CONH ₂	Me
VII-127	Pen-2	CONH ₂	Me
VII-128	Pen-3	CONH ₂	Me
VII-129	Hex-n	CONH ₂	Me
VII-130	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CONH ₂	Me
VII-131	Pen-c	CONH ₂	Me
VII-132	Hex-c	CONH ₂	Me
VII-133	CH ₂ Pr-c	CONH ₂	Me
VII-134	CH ₂ Bu-c	CONH ₂	Me
VII-135	CH ₂ Pen-c	CONH ₂	Me
VII-136	CH ₂ CH=CH ₂	CONH ₂	Me
VII-137	CH ₂ C≡CH	CONH ₂	Me
VII-138	CH ₂ C≡CCH ₃	CONH ₂	Me

【表 62】

化合物編號	R ¹	X	R ²
VII-139	Me	CN	Pr-n
VII-140	Et	CN	Pr-n
VII-141	Pr-n	CN	Pr-n
VII-142	Pr-i	CN	Pr-n
VII-143	Bu-n	CN	Pr-n
VII-144	Bu-i	CN	Pr-n
VII-145	Bu-s	CN	Pr-n
VII-146	Bu-t	CN	Pr-n
VII-147	Pen-n	CN	Pr-n
VII-148	Pen-i	CN	Pr-n
VII-149	Pen-neo	CN	Pr-n
VII-150	Pen-2	CN	Pr-n
VII-151	Pen-3	CN	Pr-n
VII-152	Hex-n	CN	Pr-n
VII-153	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CN	Pr-n
VII-154	Pen-c	CN	Pr-n
VII-155	Hex-c	CN	Pr-n
VII-156	CH ₂ Pr-c	CN	Pr-n
VII-157	CH ₂ Bu-c	CN	Pr-n
VII-158	CH ₂ Pen-c	CN	Pr-n
VII-159	CH ₂ CH=CH ₂	CN	Pr-n
VII-160	CH ₂ C≡CH	CN	Pr-n
VII-161	CH ₂ C≡CCH ₃	CN	Pr-n
VII-162	Me	CONH ₂	Pr-n
VII-163	Et	CONH ₂	Pr-n
VII-164	Pr-n	CONH ₂	Pr-n
VII-165	Pr-i	CONH ₂	Pr-n
VII-166	Bu-n	CONH ₂	Pr-n
VII-167	Bu-i	CONH ₂	Pr-n
VII-168	Bu-s	CONH ₂	Pr-n
VII-169	Bu-t	CONH ₂	Pr-n
VII-170	Pen-n	CONH ₂	Pr-n
VII-171	Pen-i	CONH ₂	Pr-n
VII-172	Pen-neo	CONH ₂	Pr-n
VII-173	Pen-2	CONH ₂	Pr-n
VII-174	Pen-3	CONH ₂	Pr-n

【表 63】

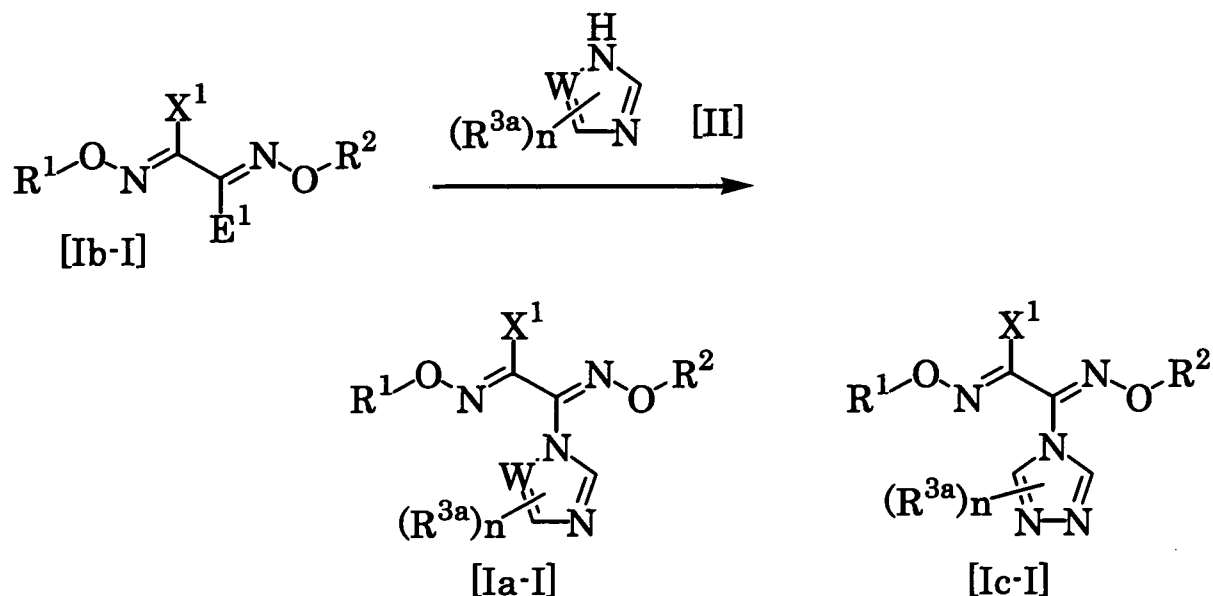
化合物編號	R ¹	X	R ²
VII-175	Hex-n	CONH ₂	Pr-n
VII-176	CH ₂ CH ₂ C(Me) ₃	CONH ₂	Pr-n
VII-177	Pen-c	CONH ₂	Pr-n
VII-178	Hex-c	CONH ₂	Pr-n
VII-179	CH ₂ Pr-c	CONH ₂	Pr-n
VII-180	CH ₂ Bu-c	CONH ₂	Pr-n
VII-181	CH ₂ Pen-c	CONH ₂	Pr-n
VII-182	CH ₂ CH=CH ₂	CONH ₂	Pr-n
VII-183	CH ₂ C≡CH	CONH ₂	Pr-n
VII-184	CH ₂ C≡CCH ₃	CONH ₂	Pr-n
VII-185	Bu-i	Me	Et
VII-186	Pr-i	Me	Et
VII-187	Pr-i	Me	Et
VII-188	Pr-i	Me	Et
VII-189	Pr-i	Me	Et
VII-190	Pr-i	Me	Et
VII-191	Pr-i	CF ₃	Me

以通式[I]表示之本發明化合物，可依照以下所示製造法製造，但不限於此等方法。

以下，例如以「通式[I-I]表示之化合物」、「式[I-I]表示之化合物」、「化合物[I-I]」，係相同含意。

[製造方法 1]

以通式[I]表示之本發明化合物當中，以[Ia-I]及[Ic-I]表示之化合物，例如可依照以下方法製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 W 及 n 與前述代表相同含意，

X^1 代表氫原子、氰基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_8$ 烷基、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ 烯基、 $\text{C}_2\sim\text{C}_6$ 炔基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ 環烷基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ 環烷基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 鹵烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷硫基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷硫基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基亞磺醯基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基磺醯基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷氧基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷氧基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、硫代胺甲醯基、 $\text{R}^4\text{R}^5\text{NCO}$ 基、 $\text{R}^6\text{R}^7\text{N}$ 基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷氧基羰基、羧基、 $\text{R}^8\text{O}(\text{HN}=\text{C})$ 基、 $\text{R}^9\text{ON}=(\text{R}^{10})\text{C}$ 基、 $\text{R}^{11}\text{S}(\text{O}=\text{C})$ 基、也可經取代基群 α 取代之苯基、具有可相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中 1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環基(該基也可經 1~5 個鹵素原子、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 鹵烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷氧基或氰基取代)，

R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 及取代基群 α ，與前述代表相同含意，

R^{3a} 代表氫原子、鹵素原子、氰基、硝基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 鹵烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷氧基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷硫基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基亞磺醯基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基磺醯基、甲醯基，

E^1 代表氯原子、溴原子、碘原子、甲烷磺醯基、甲烷磺醯基氧基或三氟甲烷磺醯基氧基等脫離基。)

化合物 [Ia-I]，可藉由使化合物 [Ib-I] 與化合物 [II] 於溶劑中，鹼存在下反應而製造。又，W 為氮原子時，可同樣地製造化合物 [Ic-I]。

本反應可使用的化合物 [II] 之使用量，相對於化合物 [Ib-I] 1 當量，通常從 1~5 當量之範圍適當選擇即可，較佳為 1~2 當量。

反應可使用之溶劑，例如二乙醚、1,2-二甲氧基乙烷或四氫呋喃等醚類；N,N-二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、1,3-二甲基-2-咪唑啉酮或 N-甲基-2-吡咯啉酮等醯胺類；二甲基亞砷或環丁砷等硫化合物類；乙腈或丙腈等腈類；己烷或庚烷等脂肪族烴類；苯、甲苯或二甲苯等芳香族烴類；1,2-二氯乙烷或氯苯等鹵素化烴類；或此等的混合物。溶劑量，相對於化合物 [Ib-I] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

本反應可使用之鹼，例如氫氧化鈉或氫氧化鉀等鹼金屬之氫氧化物類、碳酸鈉或碳酸鉀等鹼金屬之碳酸鹽類、碳酸氫鈉或碳酸氫鉀等鹼金屬之重碳酸鹽類等無機鹼類；氫化鈉或氫化鉀等金屬氫化物類；或三乙基胺或 1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯等有機鹼類等。鹼之使用量，相對於化合物 [Ib-I] 1 當量，通常可從 1~10 當量之範圍適當選擇即可，較佳為 1~5 當量。

本反應之反應溫度，通常為 -20°C 至反應系的回流溫度

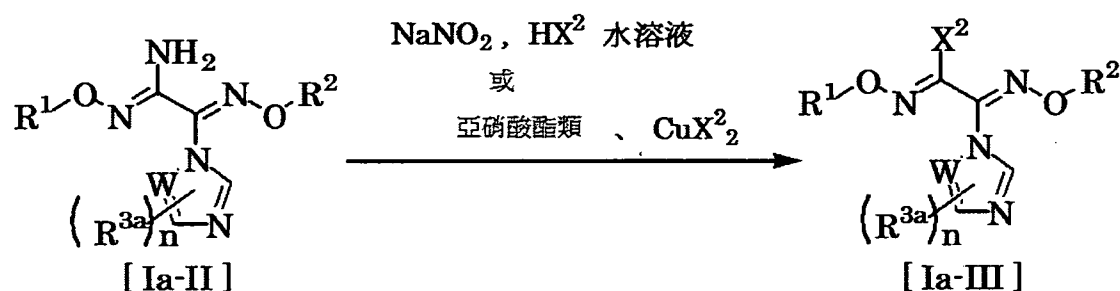
為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間，視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為1~48小時之範圍。

反應結束後，將反應混合物注加於水，以有機溶劑萃取後，進行濃縮等操作，可獲得化合物[Ia-I]或[Ia-I]及[Ic-I]。單離的化合物[Ia-I]、[Ic-I]，可視需要利用管柱層析、再結晶等進一步精製。

[製造方法 2]

以通式[I]表示之本發明化合物當中，以式[Ia-III]表示之化合物，例如可依照以下方法製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、W及n與前述代表相同含意， X^2 代表鹵素原子，較佳為代表氯原子或溴原子。)

化合物[Ia-III]，可藉由使化合物[Ia-II]與亞硝酸鈉(NaNO_2)，於鹵化氫水溶液中反應而製造。本反應可使用之亞硝酸鈉之使用量，相對化合物[Ia-II]1當量，通常可從1.0~5.0當量之範圍適當選擇，較佳為1.1~2.0當量。

本反應可使用之鹵化氫水溶液中的鹵化氫含量，相對於化合物[Ia-II]1莫耳，通常為2~200當量，水溶液之量較佳為50~100公升。又，視需要也可加入溶劑。

本反應可使用之溶劑，例如乙酸或三氟乙酸等脂肪族羧酸類或 1,2-二甲氧基乙烷或四氫呋喃等醚類。溶劑量，相對於化合物 [Ia-II] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

本反應之反應溫度，通常為 -50°C 至反應系的回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間，視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~24 小時的範圍。

反應結束後，將反應混合物過濾或注加到水中，以有機溶劑萃取後進行濃縮等操作，可將化合物 [Ia-III] 單離。經單離之化合物 [Ia-III]，視需要可利用管柱層析等進一步精製。

又，化合物 [Ia-III]，可藉由使化合物 [Ia-II] 與亞硝酸酯類於鹵化銅(II)之存在下，於溶劑中使反應而製造。

本反應可使用之鹵化銅(II)，例如溴化銅(II)或氯化銅(II)等。鹵化銅(II)之使用量，相對於化合物 [Ia-II] 1 當量，通常可從 1.0~5.0 當量之範圍適當選擇，較佳為 1.1~2.0 當量。

本反應可使用之亞硝酸酯類，例如亞硝酸第三丁酯或亞硝酸戊酯等。亞硝酸酯類之使用量，相對於化合物 [Ia-II] 1 當量，通常可從 1.0~5.0 當量之範圍適當選擇，較佳為 1.1~2.0 當量。

本反應可使用之溶劑，例如二乙醚、1,2-二甲氧基乙烷或四氫呋喃等醚類；苯、甲苯或二甲苯等芳香族烴類；乙

腈或丙腈等腈類；或此等之混合物。溶劑量，相對於化合物 [Ia-III] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

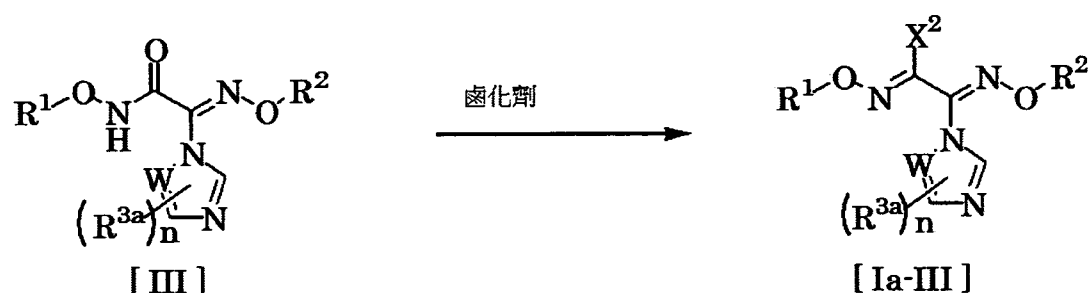
本反應之反應溫度，通常可為 -50°C 至反應系的回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，為通常 1~24 小時之範圍。

反應結束後注加於水並以有機溶劑萃取，進行濃縮等操作，可將化合物 [Ia-III] 單離。經單離之化合物 [Ia-III]，視需要可利用管柱層析等進一步精製。

[製造方法 3]

以通式 [I] 表示之本發明化合物當中，以式 [Ia-III] 表示之化合物，例如可依照以下方法製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 X^2 、W 及 n 與前述代表相同含意。)

化合物 [Ia-III]，可藉由使化合物 [III] 與鹵化劑在溶劑中反應而製造。

本反應可使用之鹵化劑，例如五氯化磷、亞硫醯氯或三苯基磷存在下之四氯化碳或四溴化碳等。鹵化劑之使用量，相對於化合物 [III] 1.0 莫耳，可從 1.0~20.0 莫耳之範圍適當選擇，較佳為 1.0~6.0 莫耳。

本反應可使用之溶劑，例如苯或甲苯等芳香族烴類；氯仿或四氯化碳等鹵化烴類；或乙腈或丙腈等腈類等。溶劑量，相對於化合物[III]1莫耳，通常為0.1~50公升，較佳為0.2~10公升。

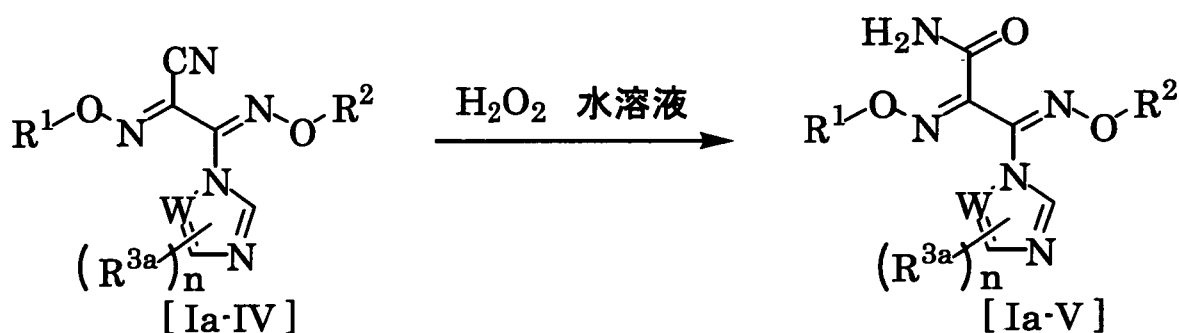
本反應之反應溫度，通常為 -50°C 至反應系的回流溫度為止的任意溫度，較佳為 0°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為1~48小時之範圍。

反應結束後，將反應混合物濃縮或注加於水，並以有機溶劑萃取後進行濃縮等操作，可將化合物[Ia-III]單離。經單離之化合物[Ia-III]視需要，可利用管柱層析、再結晶等進一步精製。

[製造方法 4]

以通式[I]表示之本發明化合物當中，以式[Ia-V]表示之化合物，例如可依照以下方法製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、W及n與前述代表相同含意。)

化合物[Ia-V]，可藉由使化合物[Ia-IV]與過氧化氫水溶液於鹼存在下反應而製造。

過氧化氫水之使用量，相對於化合物[Ia-IV]1莫耳，可從1.0~20.0莫耳之範圍適當選擇，較佳為1.0~6.0莫耳。

本反應可視需要使用溶劑，可使用之溶劑例如甲醇、乙醇或丙醇等醇類；氯仿或二氯甲烷等鹵化烴類；二甲基亞砷或環丁砷等硫化合物類；或此等之混合物。溶劑量，相對於化合物[Ia-IV]1莫耳通常為0.1~50公升，較佳為0.2~3公升。

本反應可使用之鹼，例如氫氧化鈉或氫氧化鉀等鹼金屬之氫氧化物鹽、碳酸鈉或碳酸鉀等鹼金屬之碳酸鹽類或碳酸氫鈉或碳酸氫鉀等鹼金屬之重碳酸鹽類等無機鹼類等。鹼之使用量，相對於化合物[Ia-IV]1當量，通常可從1~10當量之範圍適當選擇，較佳為0.1~2當量。

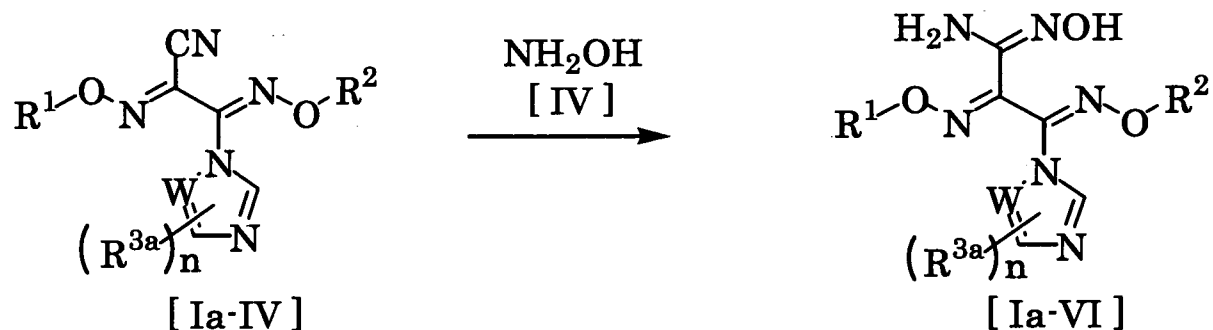
本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系中的回流溫度為止的任意溫度，較佳為 0°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間，視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為1~48小時之範圍。

反應結束後，將反應混合物注加於水並以有機溶劑萃取後，進行濃縮等操作，可將化合物[Ia-V]單離。經單離之化合物[Ia-V]，視需要可利用管柱層析、再結晶等進一步精製。

[製造方法 5]

以通式[I]表示之本發明化合物當中，以式[Ia-VI]表示之化合物，可由例如以下反應式構成的方法製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 W 及 n 與前述代表相同含意。)

藉由使化合物[Ia-IV]與化合物[IV]，於溶劑中反應，可製造化合物[Ia-VI]。又，使用之化合物[IV]可為鹽酸鹽或硫酸鹽等鹽，於此情形，可於鹼存在下反應。

本反應可使用之化合物[IV]之使用量，相對於化合物[Ia-IV]1當量，通常可從1~5當量之範圍適當選擇，較佳為1~2當量。

本反應可使用之溶劑，例如水、甲醇、乙醇或丙醇等醇類； N ， N -二甲基乙醯胺、 N ， N -二甲基甲醯胺、1,3-二甲基-2-咪唑啉酮或 N -甲基-2-吡咯啉酮等醯胺類；二甲基亞砷或環丁砷等硫化合物類；或此等之混合物。溶劑量，相對於化合物[Ia-IV]1莫耳，通常為0.1~50公升，較佳為0.2~3.0公升。

本反應可使用之鹼，例如乙酸鈉或乙酸鉀等乙酸鹼類；氫氧化鈉或氫氧化鉀等鹼金屬之氫氧化物類、碳酸鈉或碳酸鉀等鹼金屬之碳酸鹽類、碳酸氫鈉或碳酸氫鉀等鹼金屬之重碳酸鹽類等無機鹼類；甲醇鈉或乙醇鈉或第三丁醇鉀等醇之金屬鹽類；或吡啶、三乙基胺或1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯等有機鹼類等。鹼之使用量，相對於化合物[IV]1當量，通常可從1~3當量之範圍適當選擇，較

佳為 1~2 當量。

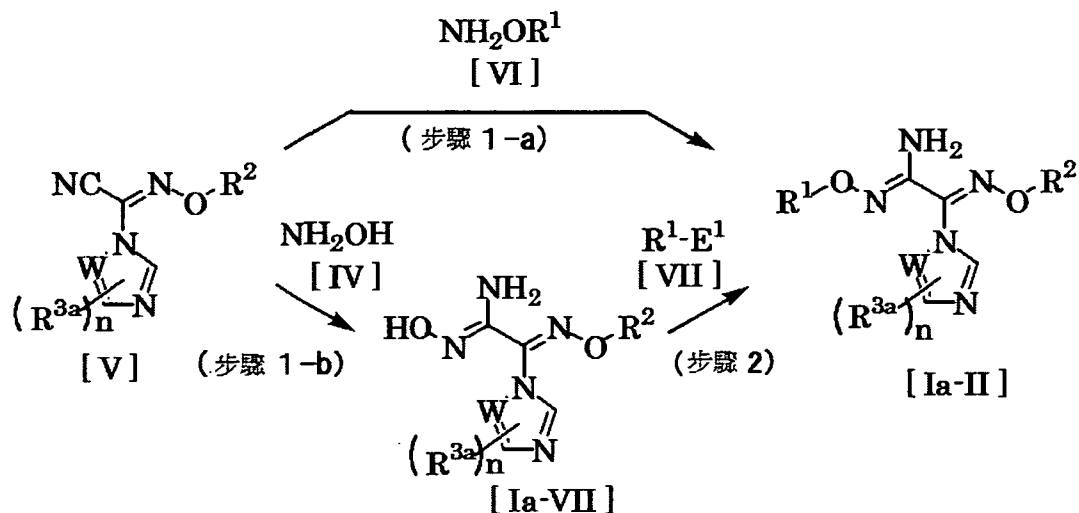
本反應之反應溫度，通常為室溫至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 50°C~100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~24 小時之範圍。

反應結束後，將反應混合物濃縮或注加於水，並以有機溶劑萃取後進行濃縮等操作，可將化合物 [Ia-VI] 單離。經單離之化合物 [Ia-VI] 視需要可利用管柱層析等進一步精製。

[製造方法 6]

以通式 [I] 表示之本發明化合物當中，以式 [Ia-II] 表示之化合物，可例如利用由以下反應式構成的方法製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 W 、 n 及 E^1 與前述代表相同含意。)

(步驟 1-a)

藉由使化合物 [V] 與化合物 [VI]，於鹼存在下、溶劑中使反應，可製造化合物 [Ia-II]。又，使用之 [VI] 可為鹽酸鹽或硫酸鹽等鹽。

本反應使用之化合物[VI]之使用量，相對於化合物[V]1當量，通常可從1~10當量之範圍適當選擇，較佳為2~5當量。

本反應可使用之溶劑及鹼，例如與前述[製造方法 5]說明過者同樣者。溶劑量，相對於化合物[V]1莫耳，通常為0.1~50公升，較佳為0.2~3.0公升。

鹼之使用量，相對於化合物[VI]1當量，通常可從1~3當量之範圍適當選擇，較佳為1~2當量。

本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為1~48小時之範圍。

反應結束後，將反應混合物濃縮或注加於水並以有機溶劑萃取後，進行濃縮等操作，可將化合物[Ia-II]單離。經單離之化合物[Ia-II]視需要可利用管柱層析等進一步精製。

(步驟 1-b)

化合物[Ia-VII]，可藉由使化合物[V]與化合物[IV]於溶劑中反應而製造。又，使用之化合物[IV]可為鹽酸鹽或硫酸鹽等鹽，於此情形，可於鹼存在下反應。

本反應可使用之化合物[IV]之使用量，相對於化合物[V]1當量，通常可從1~5當量之範圍適當選擇，較佳為1~2當量。

本反應可使用之溶劑及鹼，例如與前述[製造方法 5]

說明過者同樣者。溶劑量，相對於化合物[V]1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

使用鹼時，鹼之使用量相對於化合物[IV]1 當量，通常可從 1~3 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~2 當量。

本反應之反應溫度通常為室溫至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 50°C~100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物濃縮或注加於水、以有機溶劑萃取後、進行濃縮等操作，可將化合物[Ia-VII]單離。經單離之化合物[Ia-VII]視需要可利用管柱層析等進一步精製。

(步驟 2)

藉由使化合物[Ia-VII]與化合物[VII]，於溶劑中，鹼存在下反應，可製造化合物[Ia-II]。

本反應使用之化合物[VII]之使用量，相對於化合物[Ia-VII]1 當量，通常可從 0.5~5 當量之範圍適當選擇，較佳為 1.0~2 當量。

本反應可使用之溶劑及鹼，例如與前述[製造方法 1]說明過者同樣者。溶劑量，相對於化合物[Ia-VII]1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

鹼之使用量，相對於化合物[Ia-VII]1 當量，通常可從 1~20 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~10 當量。

本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度

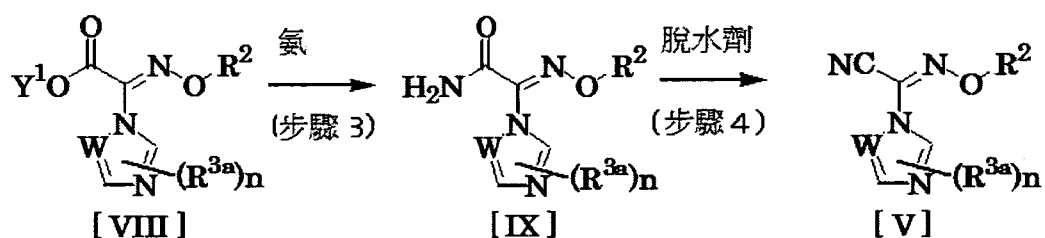
為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為1~48小時之範圍。

反應結束後，將反應混合物注加於水，以有機溶劑萃取後，進行濃縮等操作，可將化合物[Ia-II]單離。經單離之化合物[Ia-II]視需要可利用管柱層析等進一步精製。

[製造方法 7]

以通式[V]表示之化合物，例如可依照以下方法製造。



(式中， R^2 、 R^{3a} 、 W 及 n 與前述代表相同含意、 Y^1 代表 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基。)

(步驟 3)

藉由使化合物[VIII]與氨，在溶劑中使反應，可製造化合物[IX]。

本反應使用之氨之使用量，相對於化合物[VIII]1當量，通常可從1~10當量之範圍適當選擇，較佳為1~5當量。

本反應可使用之溶劑，例如水；二乙醚、1,2-二甲氧基乙烷或四氫呋喃等醚類； N,N -二甲基乙醯胺、 N,N -二甲基甲醯胺、1,3-二甲基-2-咪唑啉酮或 N -甲基-2-吡咯啉酮等醯胺類；二甲基亞碲或環丁碲等硫化合物類；甲醇、乙醇或丙醇等醇類；或此等之混合物。溶劑量，相對於化合物[VIII]1

莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

本反應之反應溫度，通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物濃縮或注加於水，以有機溶劑萃取後、進行濃縮等操作，可將化合物 [IX] 單離。經單離之化合物 [IX] 視需要可利用管柱層析等進一步精製。

(步驟 4)

藉由使化合物 [IX] 與脫水劑在溶劑中反應，可製造化合物 [V]。

本反應可使用之溶劑，例如二乙醚、1,2-二甲氧基乙烷或四氫呋喃等醚類；乙腈或丙腈等腈類；苯、甲苯或吡啶等芳香族烴類；或 1,2-二氯乙烷或氯苯等鹵化烴類。溶劑量，相對於化合物 [IX] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~10 公升。

本反應可使用之脫水劑，例如五氧化磷、五氯化磷、羥基氯化磷、三光氣、三氯乙酸酐、乙酸酐或亞硫醯氯等。脫水劑之使用量，相對於化合物 [IX] 1 當量，通常可從 1~10 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~5 當量。

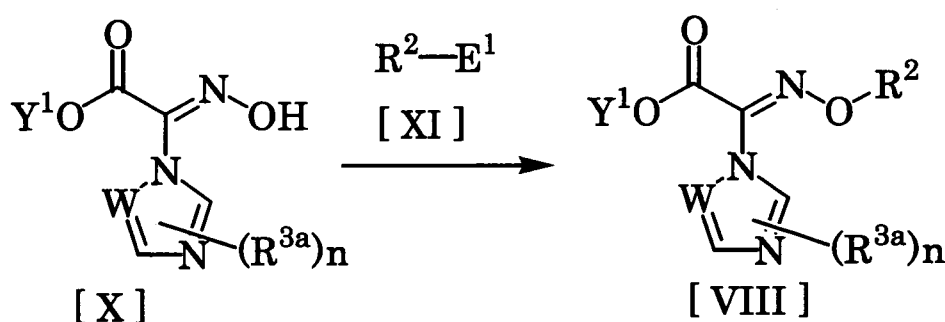
本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍之範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後，將反應混合物注加於水並以有機溶劑萃取後，進行濃縮等操作，可將化合物[V]單離。又，經單離之化合物[V]視需要可利用管柱層析、再結晶等進一步精製。

[製造方法 8]

以通式[VIII]表示之化合物，例如可依照以下方法製造。



(式中， R^2 、 R^{3a} 、 W 、 Y^1 、 n 及 E^1 與前述代表相同含意。)

藉由使化合物[X]與化合物[XI]，於溶劑中，鹼存在下反應，可製造化合物[VIII]。

本反應使用之化合物[XI]之使用量，相對於化合物[X]1當量，通常可從1.0~5.0當量之範圍適當選擇，較佳為1.1~2.0當量。

本反應可使用之溶劑及鹼，例如與前述[製造方法 1]說明過者同樣者。溶劑量，相對於化合物[X]1莫耳，通常為0.1~50公升，較佳為0.2~3.0公升。

鹼之使用量，相對於化合物[X]1當量，通常可從1~20當量之範圍適當選擇，較佳為1~10當量。

本反應之反應溫度，通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

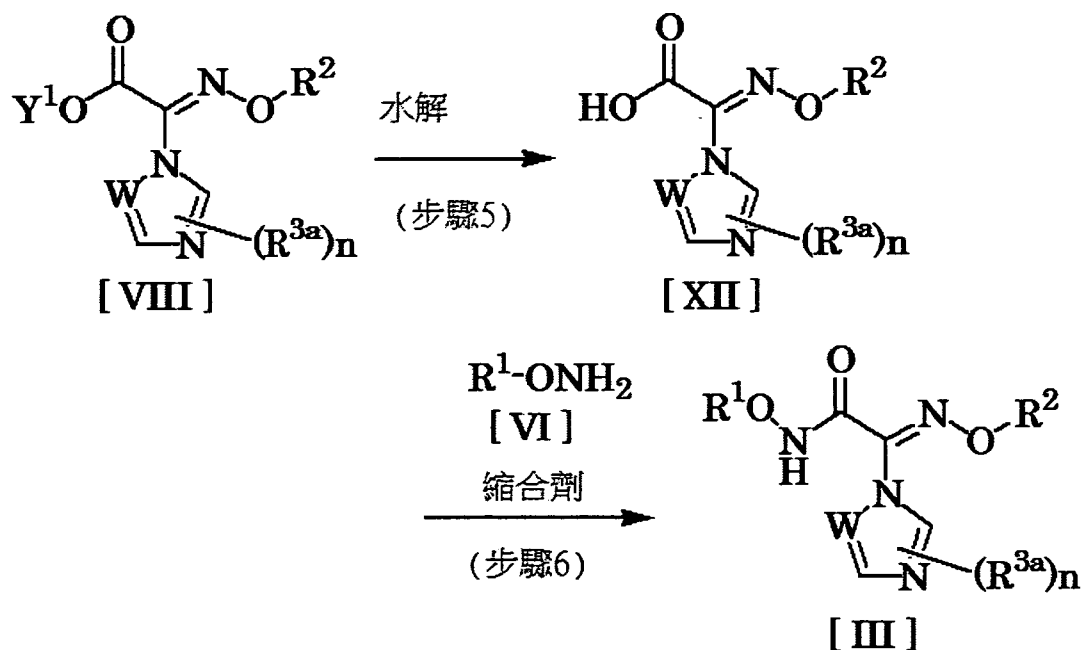
本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後，將反應混合物注加於水並以有機溶劑萃取後，進行濃縮等操作，可將化合物 [VIII] 單離。經單離之化合物 [VIII] 視需要可利用管柱層析等進一步精製。

又，前述化合物 [X] 可依據例如 Journal of the Chemical Society Perkin Transactions 1) 第 2235 頁~第 2239 頁 (1987 年) 記載之方法製造。

[製造方法 9]

通式 [III] 表示之化合物，例如可依照以下方法製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 W 、 Y^1 及 n 與前述代表相同含意。)

(步驟 5)

藉由使化合物 [VIII] 於酸存在下或鹼存在下，於溶劑中水解，可製造化合物 [XII]。

本反應可使用之鹼，例如：碳酸鉀、氫化鈉、氫氧化鈉

等無機鹼；1,8-二氮雜雙環[5.4.0]十一-7-烯(DBU)等有機鹼。鹼之使用量，相對於化合物[VIII]1莫耳，可從0.01~100莫耳之範圍適當選擇，較佳為0.1~10莫耳。

本反應可使用之酸，例如：鹽酸、氫溴酸、硫酸等無機酸；乙酸、三氟乙酸等有機酸。酸之使用量，相對於化合物[VIII]1莫耳，可使用1莫耳~大量過量使用，較佳為1~100莫耳。

本反應可使用之溶劑，例如甲醇或乙醇等醇類；四氫呋喃等醚類；丙酮或甲基異丁基酮等酮類；N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺等醯胺類；二甲基亞砷或環丁砷等硫化化合物；乙腈；水；或此等之混合物。溶劑之使用量，相對於式[VIII]1莫耳，為0.01~100公升，較佳為0.1~10公升。

本反應之反應溫度，通常可從-20℃至使用之鈍性溶劑之沸點區之範圍選擇，較佳為0℃~100℃之範圍。

本發明之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為10分鐘~48小時。

(步驟6)

藉由使化合物[XII]與化合物[VI]，於溶劑中使用縮合劑反應，可製造化合物[III]。又，使用之化合物[VI]可為鹽酸鹽或硫酸鹽等鹽，於此情形可於鹼存在下使反應。

本反應使用之化合物[VI]之使用量，相對於化合物[XII]1當量，通常可從1.0~5當量之範圍適當選擇，較佳為1.0~2當量。

縮合劑，可使用二環己基碳二醯亞胺(DCC)、N-(3-二

甲基胺基丙基)-N'-乙基碳二醯亞胺鹽酸鹽(EDC 或WSC)、N,N-羰基二咪唑、2-氯-1,3-二甲基咪唑氯鹽、2-氯-1-吡啶鎘碘鹽等。縮合劑之使用量，相對於化合物[XII]1 當量，通常可從 1~20 當量之範圍適當選擇，較佳為 1.0~10 當量。

本反應可使用之鹼，例如乙酸鈉或乙酸鉀等乙酸鹼類；甲醇鈉、乙醇鈉或第三丁醇鉀等醇之金屬鹽類；或吡啶、三乙基胺或 1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯等有機鹼類等。使用鹼時，鹼之使用量相對於化合物[VI]1 當量，通常可從 1~20 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~10 當量。

本反應可使用之溶劑，例如二乙醚、1,2-二甲氧基乙烷或四氫呋喃等醚類；N,N-二甲基乙醯胺、N,N-二甲基甲醯胺、1,3-二甲基-2-咪唑啉酮或 N-甲基-2-吡咯啉酮等醯胺類；二甲基亞碲或環丁碲等硫化合物類；苯、甲苯或二甲苯等芳香族烴類；氯仿或二氯甲烷等鹵化烴類；乙腈或丙腈等腈類；或此等之混合物。溶劑量，相對於化合物[XII]1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

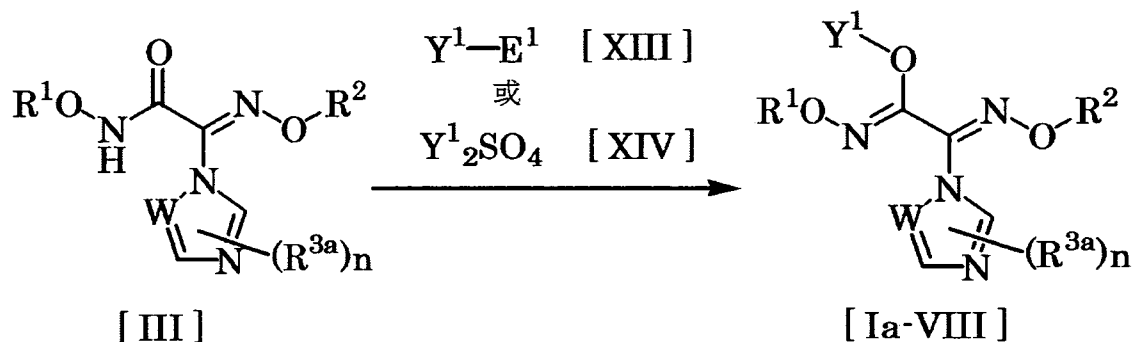
本反應之反應溫度，通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後，將反應混合物注加於水，並以有機溶劑萃取後，進行濃縮等操作，可將化合物[III]單離。經單離之化合物[III]視需要可利用管柱層析等進一步精製。

[製造方法 10]

以通式 [I] 表示之本發明化合物當中，式 [Ia-VIII] 表示之化合物例如可依照以下方法製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 Y^1 、 W 、 n 及 E^1 與前述代表相同含意。)

藉由使化合物 [III] 與化合物 [XIII] 或化合物 [XIV]，於溶劑中，鹼存在下反應，可製造化合物 [Ia-VIII]。

本反應使用之化合物 [XIII] 或化合物 [XIV] 之使用量，相對於化合物 [III] 1.0 當量，通常可從 1.0~5.0 當量之範圍適當選擇，較佳為 1.1~2.0 當量。本反應可使用之溶劑及鹼，例如與前述 [製造方法 1] 說明過者同樣者。溶劑量，相對於化合物 [III] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

鹼之使用量，相對於化合物 [III] 1 當量，通常可從 1~20 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~10 當量。

本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

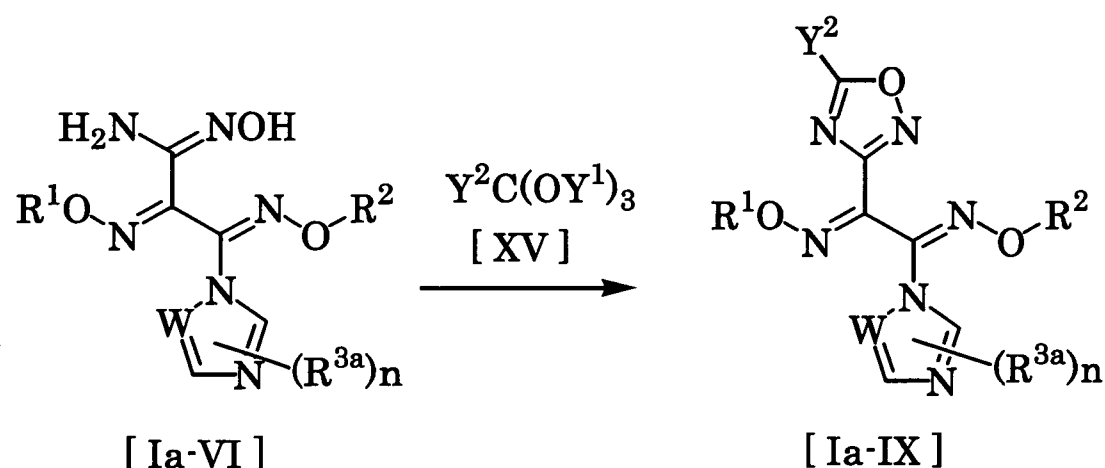
本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後，將反應混合物注加於水並以有機溶劑萃

取後，進行濃縮等操作，可將化合物 [Ia-VIII] 單離。經單離之化合物 [Ia-VIII] 視需要可利用管柱層析等進一步精製。

[製造方法 11]

以通式 [I] 表示之本發明化合物當中，式 [Ia-IX] 表示之化合物，例如可由以下反應式構成的方法製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 W 、 n 及 Y^1 與前述代表相同含意、 Y^2 代表 $C_1\sim C_6$ 烷基。)

藉由使化合物 [Ia-VI] 與化合物 [XV]，於觸媒量之酸存在下反應，可製造化合物 [Ia-IX]。

本反應可使用之化合物 [XV] 之使用量，相對於化合物 [Ia-VI] 1 當量，通常可從 1~5 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~2 當量，但也可當做溶劑使用。

本反應也可使用溶劑，能使用之溶劑例如甲醇、乙醇或丙醇等醇類或二甲基亞砷或環丁砷等硫化合物類。溶劑量，相對於化合物 [Ia-VI] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

本反應可使用之酸，例如硫酸等無機酸類；對甲苯磺酸

等磺酸類；三氟化硼等路易斯酸類；或三氟乙酸等乙酸類。

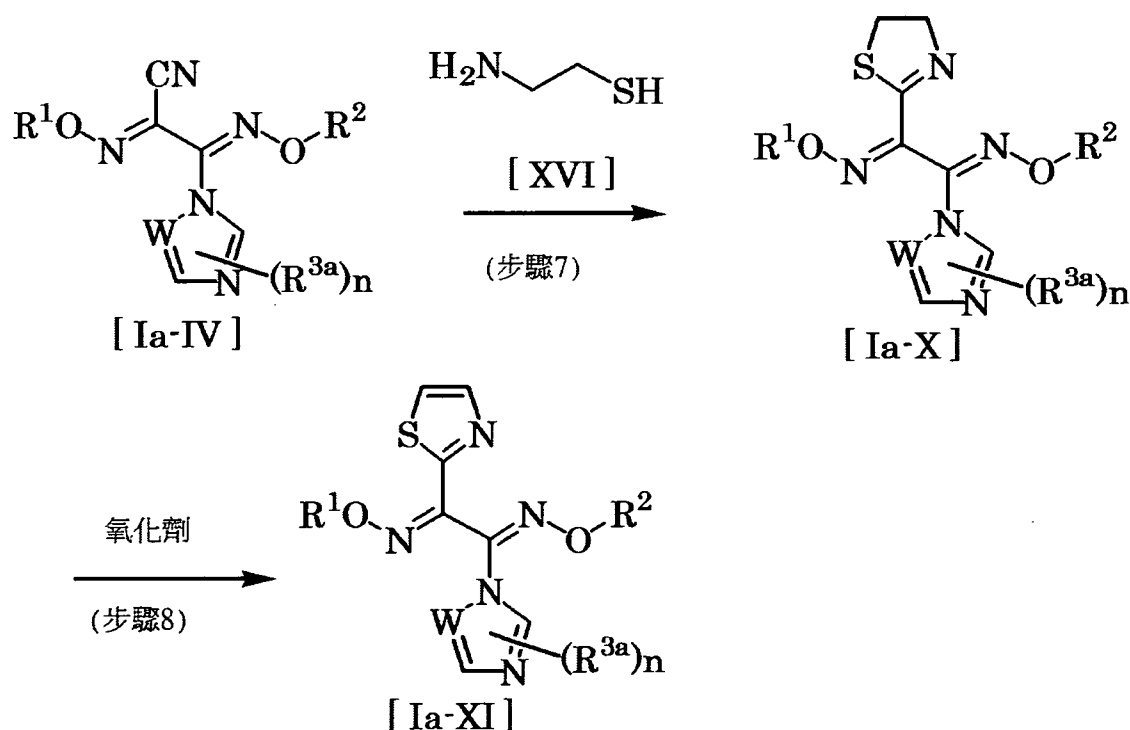
本反應之反應溫度通常為室溫至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 50℃~140℃ 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物注加於水，以有機溶劑萃取後，進行濃縮等操作，可將化合物 [Ia-IX] 單離。經單離之化合物 [Ia-IX]，視需要可利用管柱層析等進一步精製。

[製造方法 12]

以通式 [I] 表示之本發明化合物當中，式 [Ia-XI] 表示之化合物，例如可由以下反應式構成的方法製造。



(式中，R¹、R²、R^{3a}、W 及 n 與前述代表相同含意。)

(步驟 7)

藉由使化合物 [Ia-IV] 與化合物 [XVI]，於溶劑中反應，可製造化合物 [Ia-X]。又，使用之化合物 [XVI] 可為鹽

酸鹽或硫酸鹽等鹽。

本反應使用之化合物[XVI]之使用量，相對於化合物[Ia-IV]1當量，通常從1~10當量之範圍適當選擇即可，較佳為2~5當量。

本反應可使用之溶劑，例如水；二乙醚、1,2-二甲氧基乙烷或四氫呋喃等醚類；甲醇、乙醇或丙醇等醇類；或苯、甲苯或二甲苯等芳香族烴類；氯仿或二氯甲烷等鹵化烴類，溶劑量，相對於化合物[Ia-IV]1莫耳，通常為0.1~50公升，較佳為0.2~3.0公升。

本反應也可使用鹼，該鹼例如甲醇鈉或乙醇鈉或第三丁醇鉀等醇金屬鹽類；乙酸钠或乙酸鉍等乙酸鹼類；或吡啶、或三乙基胺等有機鹼類等。鹼之使用量，相對於化合物[Ia-IV]1當量，通常可從1~3當量之範圍適當選擇，較佳為1~2當量。

本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為1~48小時之範圍。

反應結束後將反應混合物濃縮或注加於水、以有機溶劑萃取後，進行濃縮等操作，可將化合物[Ia-X]單離。經單離之化合物[Ia-X]，視需要可利用管柱層析等進一步精製。

(步驟8)

藉由使化合物[Ia-X]與氧化劑，於溶劑中反應，可製

造化合物 [Ia-XI]。

本反應可使用之溶劑，例如水；苯、甲苯或二甲苯等芳香族烴類；氯仿或二氯甲烷等鹵化烴類；或此等之混合物。溶劑量，相對於化合物 [Ia-X] 1 莫耳通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~10 公升。

本反應可使用之氧化劑，例如過錳酸鉀、二氧化錳、過氧化鎳或 2,3-二氯-5,6-二氰基-對苯醌(DDQ)等。氧化劑之使用量，相對於化合物 [Ia-X] 1 當量，通常從 1~10 當量之範圍適當選擇即可，較佳為 1~5 當量。

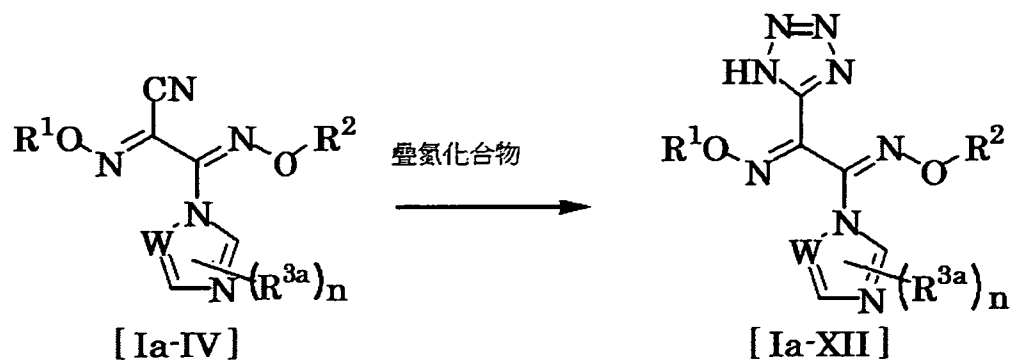
本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍之範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物注加於水，以有機溶劑萃取後進行濃縮等操作，可將化合物 [Ia-XI] 單離。又，經單離之化合物 [Ia-XI]，視需要可利用管柱層析、再結晶等進一步精製。

[製造方法 13]

以通式 [I] 表示之本發明化合物當中，式 [Ia-XII] 表示之化合物例如可由以下反應式構成的方法製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 W 及 n 與前述代表相同含意。)

藉由使化合物 [Ia-IV] 與疊氮化物化合物反應，可製造化合物 [Ia-XII]。

本反應可使用之疊氮化物化合物之使用量，相對於化合物 [Ia-IV] 1 當量，通常可從 1~5 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~2 當量。

本反應可使用之疊氮化物化合物，例如疊氮化三甲基錫或疊氮化三甲基矽等三烷基金屬類或疊氮化鈉等。又，本反應，也可於溴化鋅、氯化鋁等路易士酸存在下、或二丁基錫氧化物等錫化合物存在下反應。

本反應可使用之溶劑，例如 1,4-二噁烷或四氫呋喃等醚類；甲醇、乙醇或丙醇等醇類； N,N -二甲基乙醯胺、 N,N -二甲基甲醯胺、1,3-二甲基-2-咪唑啉酮或 N -甲基-2-吡咯啉酮等醯胺類；苯、甲苯或二甲苯等芳香族烴類；或 1,2-二氯乙烷或氯苯等鹵化烴類。溶劑量，相對於化合物 [Ia-IV] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

本反應之反應溫度通常為室溫至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 50°C ~ 140°C 之溫度範圍。

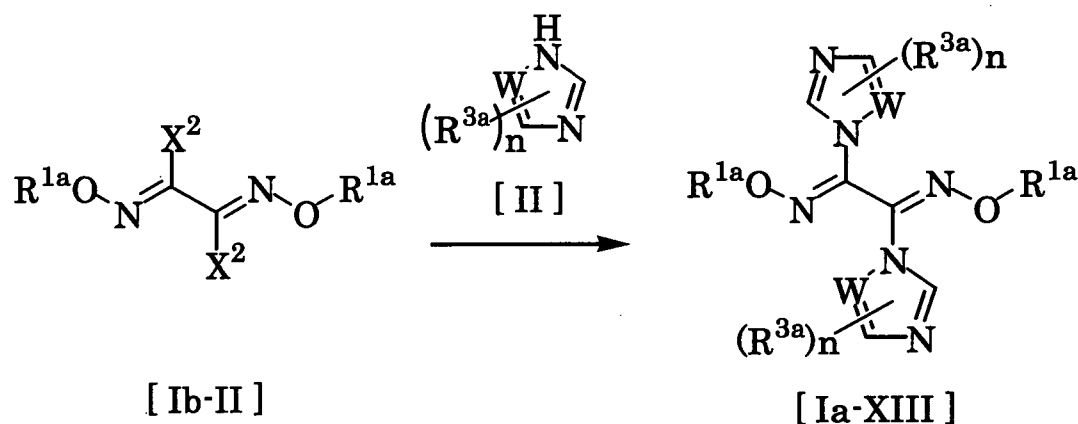
本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等

而異，通常為 1~24 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物注加於水，以有機溶劑萃取後進行濃縮等操作，可將化合物 [Ia-XII] 單離。經單離之化合物 [Ia-XII]，視需要可利用管柱層析等進一步精製。

[製造方法 14]

以通式 [I] 表示之本發明化合物當中，式 [Ia-XIII] 表示之化合物例如可由以下反應式構成的方法製造。



(式中， R^{3a} 、W、 X^2 及 n 與前述代表相同含意、 R^{1a} 代表 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基。)

化合物 [Ia-XIII]，可藉由使化合物 [Ib-II] 與化合物 [II] 於溶劑中，鹼存在下反應而製造。

本反應可使用之化合物 [II] 之使用量，相對於化合物 [Ib-II] 1 當量，通常可從 1~5 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~2 當量。

本反應可使用之鹼，例如與前述 [製造方法 1] 說明過者同樣者。鹼之使用量，相對於化合物 [Ib-II] 1 莫耳，可從 1.0~20.0 莫耳之範圍適當選擇，較佳為 1.0~6.0 莫耳。

本反應可使用之溶劑，例如與前述 [製造方法 1] 說明

過者同樣者。溶劑量，相對於化合物[Ib-II]1莫耳，通常為0.1~50公升，較佳為0.2~3.0公升。

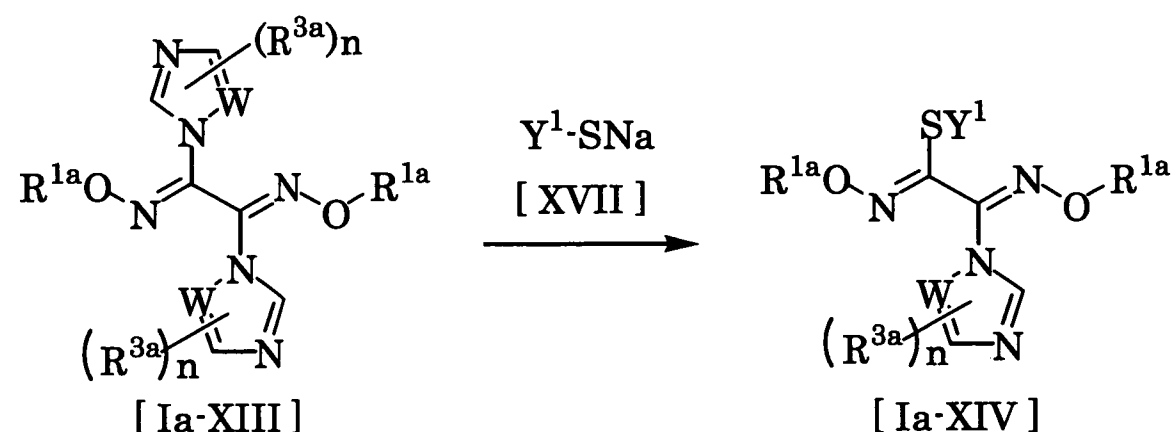
本反應之反應溫度通常為-20℃至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為-10℃~100℃之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為1~48小時之範圍。

反應結束後將反應混合物注加於水、以有機溶劑萃取後進行濃縮等操作，可將化合物[Ia-XIII]單離。經單離之化合物[Ia-XIII]，視需要可利用管柱層析或再結晶等進一步精製。

[製造方法 15]

以通式[I]表示之本發明化合物當中，式[Ia-XIV]表示之化合物，例如可由以下反應式構成的方法製造。



(式中，R^{1a}、R^{3a}、W、Y¹及n與前述代表相同含意。)

化合物[Ia-XIV]，可藉由使化合物[Ia-XIII]與化合物[XVII]於溶劑中反應而製造。

本反應可使用之化合物[XVII]之使用量，相對於化合物[Ia-XIII]1.0當量，通常可從1.0~5.0當量之範圍適當

選擇，較佳為 1.0~1.2 當量。

本反應可使用之溶劑，例如與前述[製造方法 1]說明過者同樣者。溶劑量，相對於化合物[Ia-XIII]1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

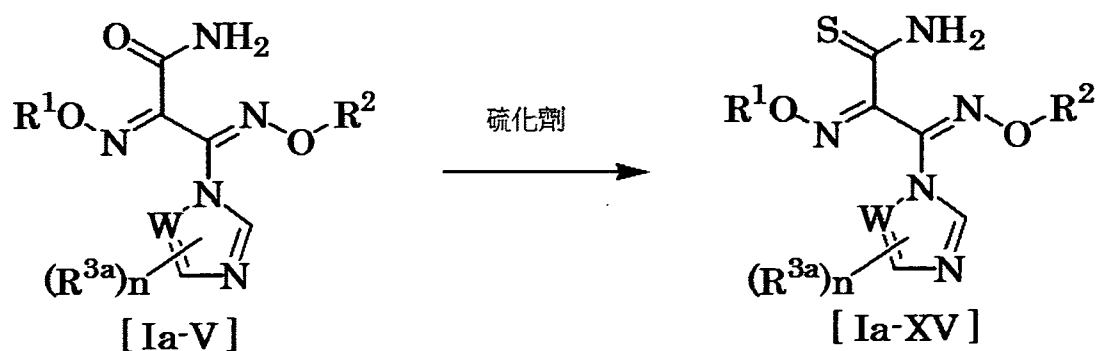
本反應之反應溫度通常為 -20°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物注加於水、以有機溶劑萃取後、進行濃縮等操作，可將化合物[Ia-XIV]單離。經單離之化合物[Ia-XIV]，視需要可利用管柱層析、再結晶等進一步精製。

[製造方法 16]

以通式[I]表示之本發明化合物當中，式[Ia-XV]表示之化合物，例如可由以下反應式構成的方法製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、W 及 n 與前述代表相同含意。)

藉由使化合物[Ia-V]與硫化劑反應，可製造化合物[Ia-XV]。

本反應可使用之硫化劑之使用量，相對於化合物

[Ia-V]1 當量，通常可從 1~5 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~2 當量。

本反應可使用之硫化劑，例如：勞森試藥 (Lawesson's 試藥)、2,4-雙(4-甲氧基苯基)-1,3,2,4-dithiadiphosphetane-2,4-二硫)或五硫化二磷等。

本反應可使用之溶劑，例如二乙醚、1,2-二甲氧基乙烷或四氫呋喃等醚類；乙腈或丙腈等腈類；苯、甲苯、二甲苯或吡啶等芳香族烴類；或 1,2-二氯乙烷或氯苯等鹵化烴類。溶劑量，相對於化合物 [Ia-V]1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

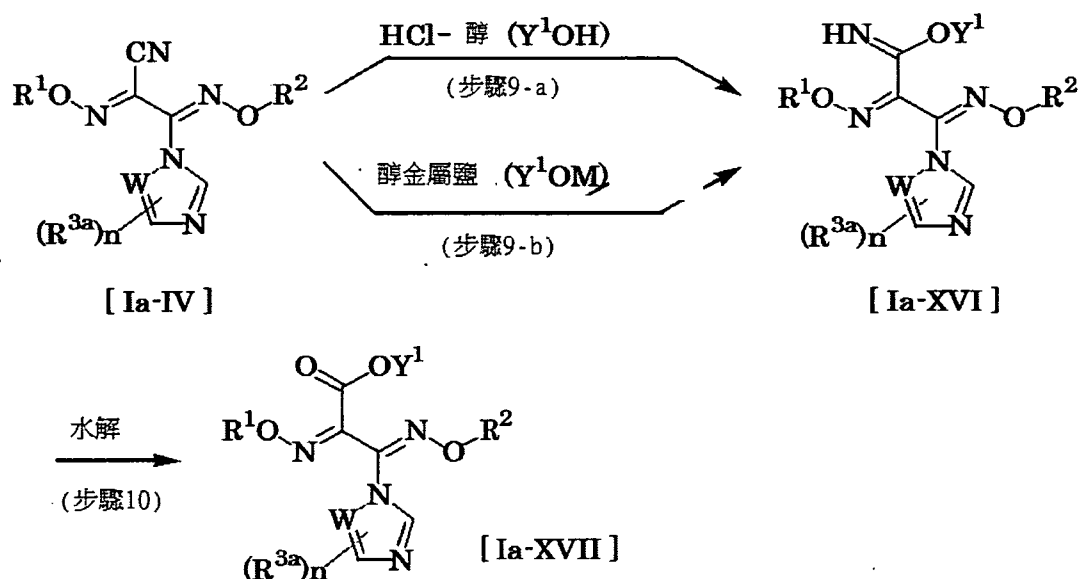
本反應之反應溫度通常為室溫至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 20°C~140°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~24 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物注加於水、以有機溶劑萃取後進行濃縮等操作，可將化合物 [Ia-XV] 單離。經單離之化合物 [Ia-XV]，視需要可利用管柱層析等進一步精製。

[製造方法 17]

以通式 [I] 表示之本發明化合物當中，式 [Ia-XVII] 表示之化合物例如可由以下反應式構成的方法製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 W 、 Y^1 及 n 與前述代表相同含意， M 代表鈉、鉀等鹼金屬。)

(步驟 9-a)

藉由使化合物 [Ia-IV]、氯化氫及甲醇或乙醇等 C1~C6 醇類 (Y^1OH) 反應，可製造化合物 [Ia-XVI]。

本反應可使用之氯化氫之使用量，相對於化合物 [Ia-IV] 1 當量，通常可從 1~10 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~5 當量。又，醇類之使用量，相對於化合物 [Ia-IV] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~10 公升。

本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍之範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後，將反應混合物濃縮後，可直接用在次一反應，也可注加於水並以有機溶劑萃取後，進行濃縮、乾燥等操作，將化合物 [Ia-XVI] 單離。又，經單離之化合物

[Ia-XVI]視需要可利用管柱層析、再結晶等進一步精製。

(步驟 9-b)

化合物 [Ia-XVI]，可藉由使化合物 [Ia-IV] 與甲醇鈉或乙醇鈉等 C1~C6 醇之金屬鹽類 (Y'OM) 於甲醇或乙醇等 C1~C6 醇 (Y'OH) 中反應而製造。

本反應可使用之醇之金屬鹽類之使用量，相對於化合物 [Ia-IV] 1 當量，通常可從觸媒量~10 當量之範圍適當選擇，較佳為 0.1~5 當量。

本反應使用之醇類之量，相對於化合物 [Ia-IV] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍之範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後，將反應混合物濃縮後，可直接用在次一反應，也可住加於水並以有機溶劑萃取後，進行濃縮、乾燥等操作，將化合物 [Ia-XVI] 單離。又，經單離之化合物 [Ia-XVI]，視需要可利用管柱層析、再結晶等進一步精製。

(步驟 10)

化合物 [Ia-XVII]，可藉由使化合物 [Ia-XVI] 於鹽酸或硫酸等酸存在下，於溶劑中反應而製造。

本反應可使用之溶劑，例如二乙醚、1,2-二甲氧基乙烷或四氫呋喃等醚類或甲醇、乙醇或丙醇等醇類或水。溶劑量，相對於化合物 [Ia-XVI] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，

較佳為 0.2~3.0 公升。

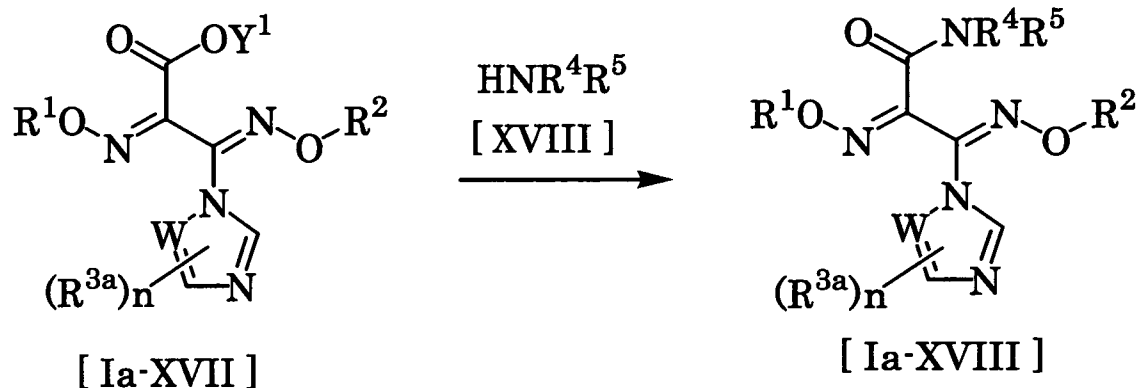
本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍之範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物注加於水，以有機溶劑萃取後，進行濃縮、乾燥等操作，可將化合物 [Ia-XVII] 單離。又，經單離之化合物 [Ia-XVII]，視需要可利用管柱層析、再結晶等進一步精製。

[製造方法 18]

以通式 [I] 表示之本發明化合物當中，式 [Ia-XVIII] 表示之化合物例如可由以下反應式構成的方法製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 R^4 、 R^5 、 W 、 Y^1 及 n 與前述代表相同含意。)

藉由使化合物 [Ia-XVII] 與化合物 [XVIII] 於路易斯酸存在下、溶劑中反應，可製造化合物 [Ia-XVIII]。又，使用之化合物 [XVIII] 可為鹽酸鹽或硫酸鹽等鹽。

本反應使用之化合物 [XVIII] 之使用量，相對於化合物 [Ia-XVII] 1 當量，通常可從 1~10 當量之範圍適當選擇，

較佳為 2~5 當量。

本反應可使用之溶劑，例如 1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷或四氫呋喃等醚類；苯、甲苯或二甲苯等芳香族烴類；或氯仿或二氯甲烷等鹵化烴類。溶劑量，相對於化合物 [Ia-XVII] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

本反應可使用之路易士酸，例如三甲基鋁或氯化鋁等鋁類。路易士酸之使用量，相對於化合物 [Ia-XVII] 1 當量，通常可從 1~3 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~2 當量。

本反應，可過量使用化合物 [XVIII]，或使用鹼代替路易士酸，該鹼例如氫氧化鈉或氫氧化鉀等鹼金屬之氫氧化物類；碳酸鈉或碳酸鉀等鹼金屬之碳酸鹽類；碳酸氫鈉或碳酸氫鉀等鹼金屬之重碳酸鹽類等無機鹼類；甲醇鈉或乙醇鈉等醇之金屬鹽類；或吡啶、三乙基胺或 1,8-二氮雜雙環 [5.4.0]-7-十一烯等有機鹼類等。鹼之使用量，相對於化合物 [Ia-XVII] 1 當量，通常可從 1~3 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~2 當量。

本反應可使用之溶劑，例如甲醇、乙醇或丙醇等醇類；1,4-二噁烷、1,2-二甲氧基乙烷或四氫呋喃等醚類；苯、甲苯或二甲苯等芳香族烴類；或氯仿或二氯甲烷等鹵化烴類。溶劑之量，相對於化合物 [Ia-XVII] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

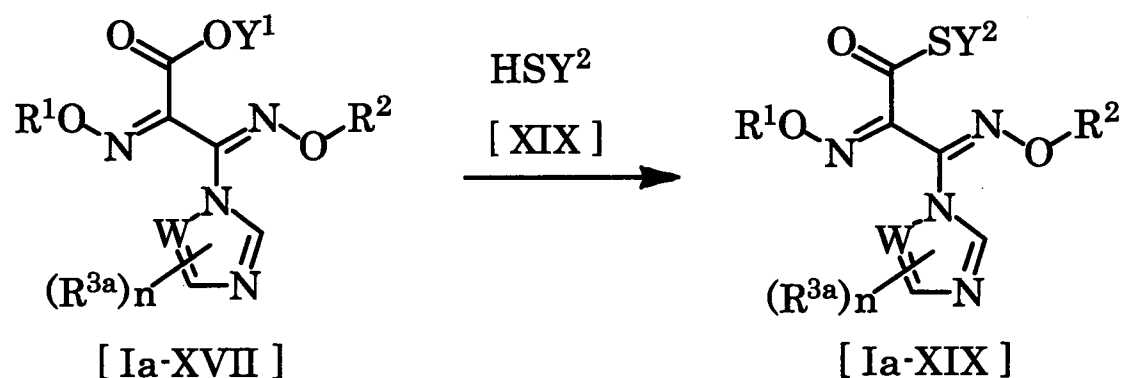
本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物濃縮或注加於水、以有機溶劑萃取後進行濃縮等操作，可將化合物 [Ia-XVIII] 單離。經單離之化合物 [Ia-XVIII]，視需要可利用管柱層析等進一步精製。

[製造方法 19]

以通式 [I] 表示之本發明化合物當中，式 [Ia-XIX] 表示之化合物例如可由以下反應式構成的方法製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 R^{3a} 、 W 、 Y^1 、 Y^2 及 n 與前述代表相同含意。)

藉由使化合物 [Ia-XVII] 與化合物 [XIX] 於路易斯酸存在下、溶劑中反應，可製造化合物 [Ia-XIX]。

本反應使用之化合物 [XIX] 之使用量，相對於化合物 [Ia-XVII] 1 當量通常可從 1~10 當量之範圍適當選擇，較佳為 2~5 當量。

本反應可使用之溶劑，例如苯、甲苯或二甲苯等芳香族烴類；氯仿或二氯甲烷等鹵化烴類。溶劑量，相對於化合物 [Ia-XVII] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

本反應可使用之路易士酸，例如三甲基鋁或氯化鋁等鋁化合物類。路易士酸之使用量，相對於化合物[1a-XVII]1當量，通常可從1~3當量之範圍適當選擇，較佳為1~2當量。

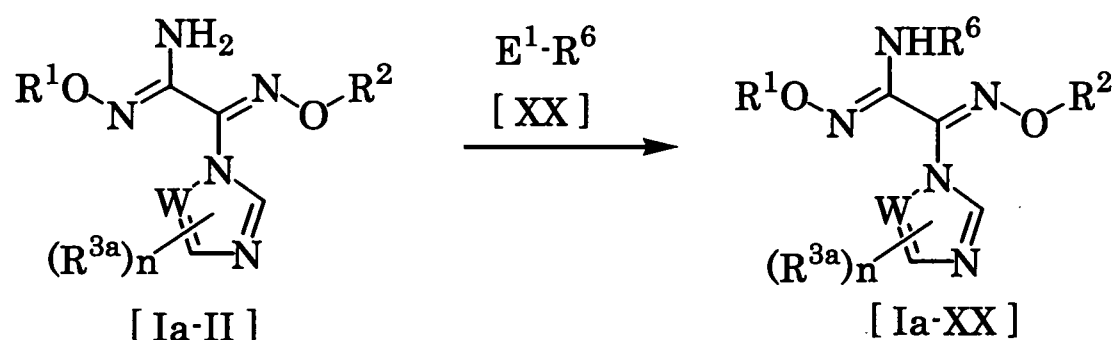
本反應之反應溫度通常為-50℃至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為-10℃~100℃之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為1~48小時之範圍。

反應結束後將反應混合物濃縮或注加於水、以有機溶劑萃取後，進行濃縮等操作，可將化合物[1a-XIX]單離。經單離之化合物[1a-XIX]，視需要可利用管柱層析等進一步精製。

[製造方法 20]

以通式[I]表示之本發明化合物當中，式[1a-XX]表示之化合物例如可由以下反應式構成的方法製造。



(式中，R¹、R²、R^{3a}、R⁶、W、n及E¹與前述代表相同含意。)

藉由使化合物[1a-II]與化合物[XX]於溶劑中，鹼存在下反應，可製造化合物[1a-XX]。

本反應使用之化合物[XX]之使用量，相對於化合物

[Ia-II] 1.0 當量，通常可從 1.0~5.0 當量之範圍適當選擇，較佳為 1.1~2.0 當量。

本反應可使用之溶劑及鹼，例如與前述[製造方法 1]說明過者同樣者。溶劑量，相對於化合物[Ia-II] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

鹼之使用量，相對於化合物[Ia-II] 1 當量，通常可從 1~20 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~10 當量。

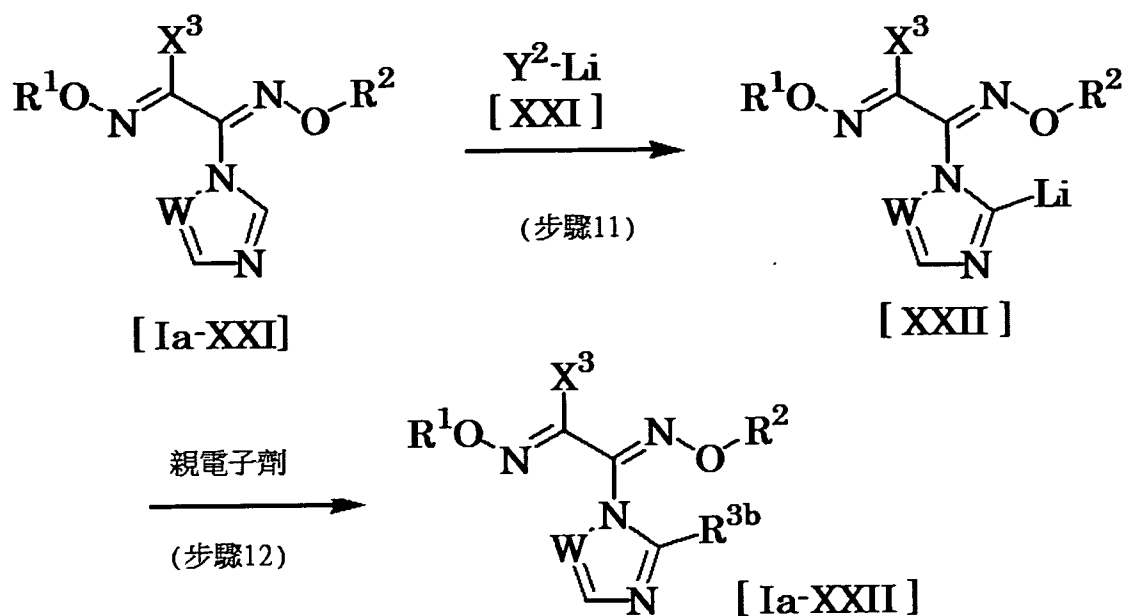
本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~24 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物注加於水、以有機溶劑萃取後進行濃縮等操作，可將化合物[Ia-XX]單離。經單離之化合物[Ia-XX]視需要可利用管柱層析等進一步精製。

[製造方法 21]

以通式[I]表示之本發明化合物當中，式[Ia-XXII]表示之化合物例如可由以下反應式構成的方法製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 W 及 Y^2 與前述代表相同含意，

X^3 代表氫原子、氰基、 $C_1\sim C_8$ 烷基、 $C_2\sim C_6$ 烯基、 $C_2\sim C_6$ 炔基、 $C_3\sim C_6$ 環烷基、 $C_3\sim C_6$ 環烷基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷硫基、 $C_1\sim C_6$ 烷硫基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 R^6R^7N 基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基羰基、也可經取代基群 α 取代之苯基、具有可相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中 1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環基(該碳數 1 至 9 之雜環基也可經 1~5 個鹵素原子、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基或氰基取代)， R^{3b} 代表鹵素原子、巰基、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷硫基、甲醯基，

R^6 、 R^7 及取代基群 α 與前述代表相同含意。)

(步驟 11)

藉由使化合物 [Ia-XXI] 與烷基鋰化合物 [XXI] 於溶劑中反應，可製造化合物 [XXII]。

本反應使用之化合物 [XXI] 之使用量，相對於化合物 [Ia-XXI] 1.0 當量，通常可從 1.0~5.0 當量之範圍適當選

擇，較佳為 1.1~2.0 當量。

本反應可使用之溶劑，例如二乙醚、1,2-二甲氧基乙烷或四氫呋喃等醚類。溶劑量，相對於化合物 [Ia-XXI] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

本反應之反應溫度通常為 -100°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -70°C ~ 0°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~24 小時之範圍。

反應結束後不經精製等，將含化合物 [XXII] 之反應混合物直接用在次一反應。

(步驟 12)

藉由使含化合物 [XXII] 之反應混合物與親電子劑於溶劑中反應，可製造化合物 [Ia-XXII]。

本反應可使用之親電子劑，例如：氯、溴等鹵素；碘化甲烷、溴化乙烷等鹵化 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷；1-氯-2-溴乙烷、六氯乙烷等鹵化 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 鹵烷；二甲基二硫醚、二乙基二硫醚等二 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基二硫醚；或硫；或 N,N-二甲基甲醯胺等。使用親電子劑之使用量，相對於化合物 [XXII] 1.0 莫耳，可從 1.0~5.0 莫耳之範圍適當選擇，較佳為 1.1~2.0 莫耳。

本反應之反應溫度通常為 -100°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -70°C ~ 0°C 之溫度範圍。

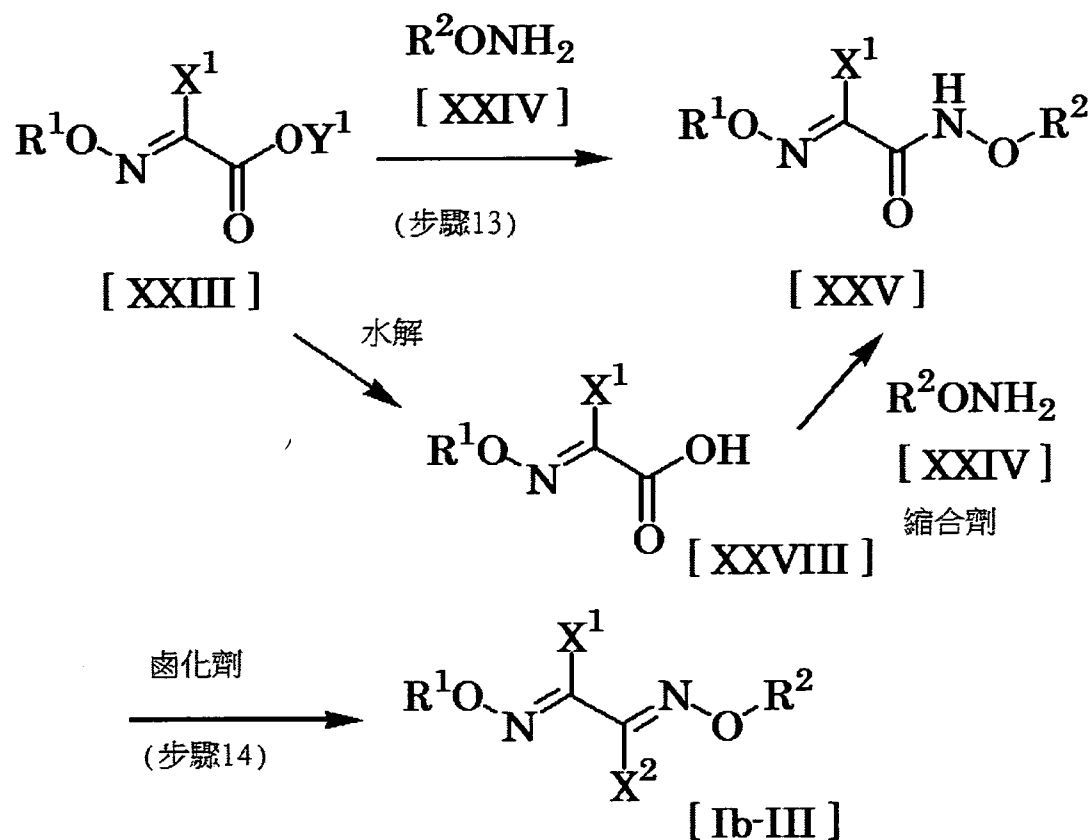
本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常、1~24 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物注加於水、以有機溶劑萃取

後進行濃縮等操作，可將化合物[1a-XXII]單離。經單離之化合物[1a-XXII]，視需要可利用管柱層析等進一步精製。

[製造方法 22]

以通式[I]表示之本發明化合物當中，式[1b-III]表示之化合物例如可由以下反應式構成的方法製造。



(式中，R¹、R²、X¹、X²及Y¹與前述代表相同含意。)

(步驟 13)

藉由使化合物[XXIII]與化合物[XXIV]於路易斯酸存在下於溶劑中反應，可製造化合物[XXV]。

本反應使用之化合物[XXIV]之使用量，相對於化合物[XXIII]1當量，通常可從1~10當量之範圍適當選擇，較佳為2~5當量。

本反應可使用之溶劑及路易斯酸，例如於前述[製造方

法 18]說明過者相同者。溶劑量，相對於化合物[XXIII]1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

路易士酸之使用量，相對於化合物[XXIII]1 當量通常可從 1~3 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~2 當量。

本反應，可使用鹼代替路易士酸，該鹼，例如與前述[製造方法 18]說明過者相同者。鹼之使用量，相對於化合物[XXIII]1 當量，通常可從 1~3 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~2 當量。

本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物濃縮或注加於水、以有機溶劑萃取後，進行濃縮等操作，可將化合物[XXV]單離。經單離之化合物[XXV]視需要可利用管柱層析等進一步精製。

又，化合物[XXV]，可藉由使化合物[XXIII]於酸或鹼存在下水解而製造之化合物[XXVIII]，與化合物[XXIV]，在溶劑中，縮合劑存在下反應而製造。

本反應使用之化合物[XXIV]之使用量，相對於化合物[XXVIII]1 當量通常可從 1.0~5 當量之範圍適當選擇，較佳為 1.1~2 當量。

本反應可使用之縮合劑及溶劑，例如與前述[製造方法 9]說明過者同樣者。縮合劑之使用量，相對於化合物[XXVIII]1 當量，通常可從 1~20 當量之範圍適當選擇，較

佳為 1.2~10 當量。溶劑量，相對於化合物 [XXVIII] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~24 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物注加於水，以有機溶劑萃取並進行濃縮等操作，可將化合物 [XXV] 單離。經單離之化合物 [XXV] 視需要可利用管柱層析等進一步精製。

(步驟 14)

藉由使化合物 [XXV] 與鹵化劑於溶劑中反應，可製造化合物 [Ib-III]。

本反應可使用之鹵化劑，例如與前述 [製造方法 3] 說明過者同樣者。鹵化劑之使用量，相對於化合物 [XXV] 1.0 莫耳，可從 1.0~20.0 莫耳之範圍適當選擇，較佳為 1.0~6.0 莫耳。

本反應可使用之溶劑，例如與前述 [製造方法 3] 說明過者同樣者。溶劑量，相對於化合物 [XXV] 1.0 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 0°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

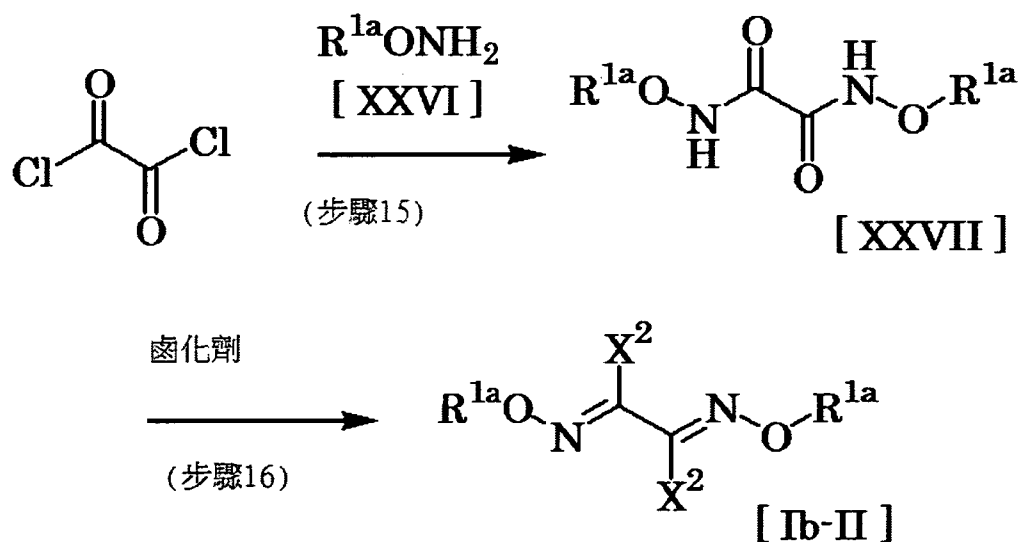
反應結束後將反應混合物濃縮或注加於水、以有機溶

劑萃取後進行濃縮等操作，可將化合物[Ib-III]單離。經單離之化合物[Ib-III]，視需要可利用管柱層析、再結晶等進一步精製。

又，前述化合物[XXIII]可依據例如 Journal of Medicinal Chemistry 第 4608 頁~第 4612 頁(1992 年)或 Journal of Organic Chemistry 第 496 頁~第 500 頁(2001 年)記載之方法製造。

[製造方法 23]

以通式[I]表示之本發明化合物當中，式[Ib-II]]表示之化合物例如可由以下反應式構成的方法製造。



(式中， R^{1a} 及 X^2 與前述代表相同含意。)

(步驟 15)

藉由使草醯基二氯與化合物[XXVI]於鹼存在下、溶劑中反應，可製造化合物[XXVII]。

本反應可使用之化合物[XXVI]之使用量，相對於草醯基二氯 1 當量，通常可從 2~5 當量之範圍適當選擇，較佳

為 2.0~3.0 當量。

反應可使用之溶劑，例如二乙醚、1,2-二甲氧基乙烷或四氫呋喃等醚類；乙腈或丙腈等腈類；己烷或庚烷等脂肪族烴類；苯、甲苯或二甲苯等芳香族烴類；1,2-二氯乙烷或氯苯等鹵化烴類；或此等之混合物。溶劑量，相對於草醯基二氯 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

本反應可使用之鹼，例如碳酸鈉或碳酸鉀等鹼金屬之碳酸鹽類；碳酸氫鈉或碳酸氫鉀等鹼金屬之重碳酸鹽類等無機鹼類；氫化鈉或氫化鉀等金屬氫化物類；或三乙基胺或 1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯等有機鹼類等。鹼之使用量，相對於化合物草醯基二氯 1 當量，通常可從 2~10 當量之範圍適當選擇，較佳為 2~5 當量。

本反應之反應溫度通常為 -20°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物注加於水、以有機溶劑萃取後進行濃縮等操作，可將化合物 [XXVII] 單離。經單離之化合物 [XXVII]，視需要可利用管柱層析、再結晶等進一步精製。

(步驟 16)

藉由使化合物 [XXVII] 與鹵化劑於溶劑中反應，可製造化合物 [Ib-II]。

本反應可使用之鹵化劑，例如與前述[製造方法 3]說

明過者同樣者。鹵化劑之使用量，相對於通式[XXVII]1.0莫耳，可從1.0~20.0莫耳之範圍適當選擇，較佳為1.0~6.0莫耳。

本反應可使用之溶劑，例如與前述[製造方法 3]說明過者同樣者。溶劑量，相對於化合物[XXVII]1莫耳，通常為0.1~50公升，較佳為0.2~3.0公升。

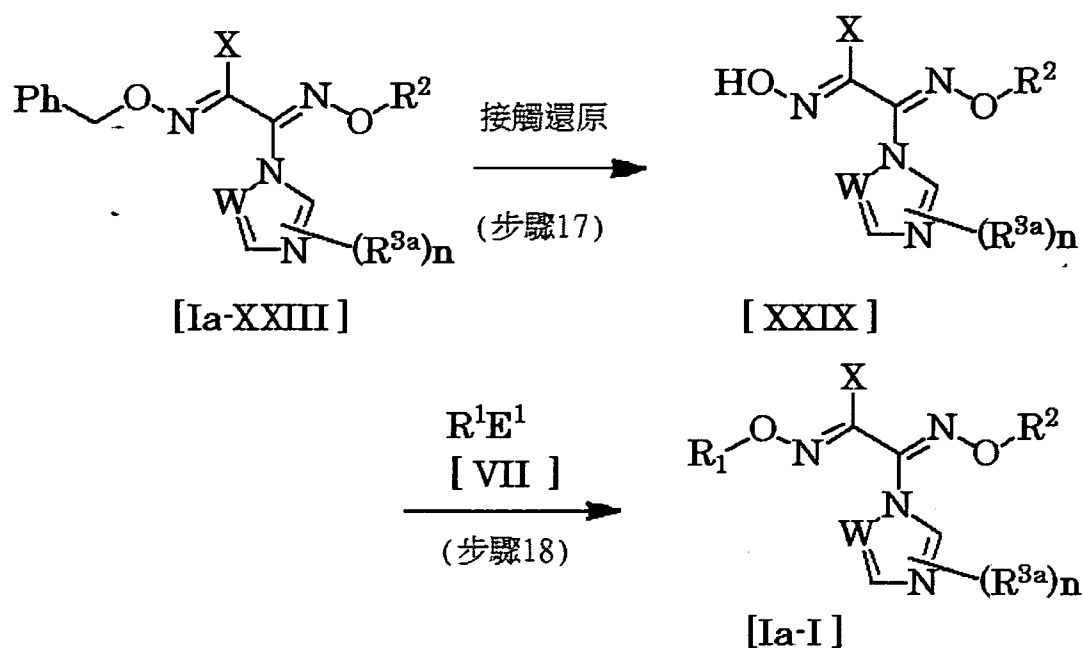
本反應之反應溫度通常為-50℃至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為0℃~100℃之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為1~48小時之範圍。

反應結束後將反應混合物濃縮或注加於水、以有機溶劑萃取後，進行濃縮等操作，可將化合物[Ib-II]單離。經單離之化合物[Ib-II]，視需要可利用管柱層析、再結晶等進一步精製。

[製造方法 24]

通式[Ia]表示之本發明化合物當中，式[Ia-I]表示之化合物例如可利用由以下反應式構成的方法製造。



(式中， R^2 、 R^{3a} 、X、W、 E^1 及n與前述代表相同含意。)

(步驟 17)

藉由使化合物 [Ia-XXIII] 與氫於觸媒存在下、溶劑中反應，可製造化合物 [XXIX]。

本反應可使用之觸媒，例如鈀或氫氧化鈀或使鈀或氫氧化鈀載持於活性碳者。

本反應可使用之觸媒之使用量，相對於 [Ia-XXIII] 1 當量，通常可從 0.01~0.1 當量之範圍適當選擇，較佳為 0.02~0.05 當量。

反應可使用之溶劑，例如二乙醚、1,4-二噁烷或四氫呋喃等醚類；甲醇或乙醇等醇類；乙酸乙酯或乙酸丁基等乙酸酯類；或乙酸等。溶劑量，相對於 [Ia-XXIII] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 0°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等

而異，通常為 1~48 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物濃縮或注加於水以有機溶劑萃取後進行濃縮等操作，可將化合物 [XXIX] 單離。經單離之化合物 [XXIX]，視需要可利用管柱層析、再結晶等進一步精製。

(步驟 18)

藉由使化合物 [XXIX] 與 [VII] 於鹼存在下、溶劑中反應，可製造化合物 [Ia-I]。

本反應使用之化合物 [VII] 之使用量，相對於化合物 [XXIX] 1 當量，通常可從 1.0~5.0 當量之範圍適當選擇，較佳為 1.0~2.0 當量。

本反應可使用之溶劑及鹼，例如與前述 [製造方法 1] 說明過者同樣者。溶劑量，相對於化合物 [XXIX] 1 莫耳，通常為 0.1~50 公升，較佳為 0.2~3.0 公升。

鹼之使用量，相對於化合物 [XXIX] 1 當量，通常可從 0.5~20 當量之範圍適當選擇，較佳為 1~10 當量。

本反應之反應溫度通常為 -50°C 至反應系之回流溫度為止的任意溫度，較佳為 -10°C ~ 100°C 之溫度範圍。

本反應之反應時間視反應溫度、反應基質、反應量等而異，通常為 1~24 小時之範圍。

反應結束後將反應混合物注加於水、以有機溶劑萃取後、進行濃縮等操作，可將化合物 [Ia-I] 單離。經單離之化合物 [Ia-I]，視需要可利用管柱層析等進一步精製。

本發明之有害生物防除劑，特徵為含有本發明之以通

式[I]表示之烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽當做有效成分。本發明之有害生物防除劑，代表者為殺蟲劑。

本發明之有害生物防除劑，視需要可含有農藥製劑通常使用的添加成分(擔體)。

該添加成分，例如固體擔體或液體擔體等擔體、界面活性劑、黏結劑或黏著賦予劑、增黏劑、著色劑、擴展劑、延展劑、抗凍劑、抗固結劑、崩散劑、抗分解劑等，其他視需要可使用防腐劑或植物片等當做添加成分。

此等添加成分可使用1種，也可組合使用2種以上。

以下說明上述添加成分。

固體擔體，例如：葉蠟石黏土、高嶺黏土、矽石黏土、滑石、矽藻土、沸石、膨潤土、酸性白土、活性白土、attapulgas 黏土、蛭石(vermiculite)、珍珠岩(pearlite)、輕石、白碳(合成矽酸、合成矽酸鹽等)、二氧化鈦等礦物系擔體；木質粉、玉米莖、胡桃殼、果實核、麥麩、大鋸屑、麩、黃豆粉、粉末纖維素、澱粉、糊精、糖類等植物性擔體；碳酸鈣、硫酸銨、硫酸鈉、氯化鉀等無機鹽類擔體；聚乙烯、聚丙烯、聚氯化乙烯、聚乙酸乙烯酯、乙烯-乙酸乙烯基共聚物、尿素-醛樹脂等高分子擔體等。

液體擔體例如：甲醇、乙醇、丙醇、異丙醇、丁醇、環己醇等一元醇類；乙二醇、二乙二醇、丙二醇、己二醇、聚乙二醇、聚丙二醇、甘油等多元醇類；丙烯系二醇醚等多元醇衍生物類；丙酮、甲乙酮、甲基異丁酮、二異丁酮、環己酮、異佛爾酮等酮類；乙醚、二噁烷、賽路蘇、二丙醚、四

氫呋喃等醚類；正烷烴、環烷烴、異烷烴(isoparaffin)、煤油、礦油等脂肪族烴類；甲苯、 C_9 - C_{10} 烷基苯、二甲苯、溶劑石油腦、烷基萘、高沸點芳香族烴等芳香族烴類；二氯乙烷、氯仿、四氯化碳等鹵化烴類；乙酸乙酯、鄰苯二甲酸二異丙酯、鄰苯二甲酸二丁酯、鄰苯二甲酸二辛酯、己二酸二甲酯等酯類； γ -丁內酯等內酯類；二甲基甲醯胺、二乙基甲醯胺、二甲基乙醯胺、N-烷基吡咯啉酮等醯胺類；乙腈等腈類；二甲基亞碲等硫化合物類；黃豆油、菜籽油、綿籽油、椰子油、蓖麻子油等植物油；水等。

界面活性劑，不特別限制，較佳為於水中顯示凝膠化或膨潤性者，例如山梨糖醇酐脂肪酸酯、聚氧化乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯、蔗糖脂肪酸酯、聚氧化乙烯脂肪酸酯、聚氧化乙烯樹脂酸酯、聚氧化乙烯脂肪酸二酯、聚氧化乙烯烷醚、聚氧化乙烯烷基苯醚、聚氧化乙烯二烷基苯醚、聚氧化乙烯烷基苯醚福馬林縮合物、聚氧化乙烯聚氧化丙烯嵌段聚合物、烷基聚氧化乙烯聚丙烯嵌段聚合物醚、聚氧化乙烯烷基胺、聚氧化乙烯脂肪酸醯胺、聚氧化乙烯脂肪酸雙苯醚、聚烯烴基苄基苯醚、聚氧化烯烴基苯乙烯基苯醚、乙炔二醇、聚氧化烯烴基加成乙炔二醇、聚氧化乙烯醚型矽酮、酯型矽酮、氟系界面活性劑、聚氧化乙烯蓖麻子油、聚氧化乙烯硬化蓖麻子油等非離子性界面活性劑；烷基硫酸鹽、聚氧化乙烯烷醚硫酸鹽、聚氧化乙烯烷基苯醚硫酸鹽、聚氧化乙烯苯乙烯基苯醚硫酸鹽、烷基苯磺酸鹽、木質素磺酸鹽、烷基磺基琥珀酸鹽、萘磺酸鹽、烷基

萘磺酸鹽、萘磺酸之福馬林縮合物之鹽、烷基萘磺酸之福馬林縮合物之鹽、脂肪酸鹽、聚羧酸鹽、N-甲基-脂肪酸肌胺酸酯、樹脂酸鹽、聚氧化乙烯烷醚磷酸鹽、聚氧化乙烯烷基苯醚磷酸鹽等陰離子性界面活性劑；

月桂基胺鹽酸鹽、硬脂基胺鹽酸鹽、油基胺鹽酸鹽、硬脂基胺乙酸鹽、硬脂基胺基丙基胺乙酸鹽、烷基三甲基銨氯、烷基二甲基亞苳基氯等烷基胺鹽等陽離子界面活性劑；

二烷基二胺基乙基甜菜鹼、烷基二甲基苳基甜菜鹼等甜菜鹼型、二烷基胺基乙基甘胺酸、烷基二甲基苳基甘胺酸等胺基酸型等兩性界面活性劑等。

黏結劑或黏著賦予劑，例如：羧基甲基纖維素或其鹽、糊精、水溶性澱粉、黃耆膠、瓜爾膠、蔗糖、聚乙炔基吡咯烷酮、阿拉伯膠、聚乙炔醇、聚乙炔基乙酸酯、聚丙烯酸鈉、平均分子量 6000~20000 之聚乙二醇、平均分子量 10 萬~500 萬之聚氧乙炔、天然磷脂質（例如腦磷脂、卵磷脂等）等。

增黏劑，例如如黃耆膠、瓜爾膠、羧基甲基纖維素、聚乙炔基吡咯烷酮、羧基乙炔基聚合物、丙烯酸系聚合物、澱粉衍生物、多糖類之水溶性高分子；如高純度膨潤土、白碳之無機微粉等。

著色劑，例如氧化鐵、氧化鈦、普魯士藍(Prussian blue)之無機顏料；如茜素(alizarin)染料、偶氮染料、金屬酞花青染料之有機染料等。

擴展劑，例如矽酮系界面活性劑、纖維素粉末、糊精、加工澱粉、聚胺基羧酸酯化合物、交聯聚乙烷基吡咯烷酮、馬來酸與苯乙烯類、甲基丙烯酸共聚物、多元醇之聚合物與二羧酸酐之半酯、聚苯乙烯磺酸之水溶性鹽等。

延展劑，例如二烷基磺基琥珀酸鈉、聚氧化乙烯烷醚、聚氧化乙烯烷基苯醚、聚氧化乙烯脂肪酸酯等各種界面活性劑；石蠟、萜烯、聚醯胺樹脂、聚丙烯酸酸鹽、聚氧化乙烯、蠟、聚乙烷基烷醚、烷基酚福馬林縮合物、合成樹脂乳劑等。

抗凍劑，例如乙二醇、二乙二醇、丙二醇、甘油等多元醇類等。

抗固結劑，例如：澱粉、藻酸、甘露糖、半乳糖等多糖類；聚乙烷基吡咯烷酮、白碳、酯膠、石油樹脂等。

崩散劑，例如：三聚磷酸鈉、六偏磷酸鈉、硬脂酸金屬鹽、纖維素粉末、糊精、甲基丙烯酸酯之共聚物、聚乙烷基吡咯烷酮、聚胺基羧酸螯合化合物、磺化苯乙烯·異丁烯·馬來酸酐共聚物、澱粉·聚丙烯腈接枝共聚物等。

抗分解劑，例如沸石、生石灰、氧化鎂之乾燥劑；酚系、胺系、硫系、磷酸系等抗氧化劑；水楊酸系、二苯基酮系等紫外線吸收劑等。

本發明之有害生物防除劑中，含有上述添加成分時，其含有比例，以質量基準計，擔體通常於 5~95%，較佳為 20~90%、界面活性劑通常於 0.1%~30%，較佳於 0.5~10%，其他添加劑於 0.1~30%，較佳於 0.5~10%之範圍中選擇。

本發明之有害生物防除劑，可製劑成粉劑、粉粒劑、粒劑、水合劑、水溶劑、顆粒水合劑、錠劑、大容量(jumbo)劑、乳劑、油劑、液劑、水懸劑、乳劑、微乳劑、懸乳劑、微量散布劑、微膠囊劑、薰煙劑、氣溶劑、噴劑、糊劑等任意劑型後使用。

此等製劑實際使用時，可以直接使用或以水等稀釋劑稀釋成既定濃度後使用。含有本發明化合物之各種製劑或其稀釋物施用時，可利用通常一般施行之施用方法，亦即散布(例如噴霧、噴水氣(misting)、霧化(atomizing)、散粉、散粒、水面施用、箱施用等)、土壤施用(例如混入、灌注等)、表面施用(例如塗布、粉衣、被覆等)、浸漬、毒餌、薰煙施用等進行。又，也可將前述有效成分混在飼料後對於家畜給予，以防除在排泄物的有害蟲、尤其有害昆蟲發生、成長。

本發明之有害生物防除劑中，有效成分之配合比例，可視需要適當選擇。例如，

製成粉劑、粉粒劑等時，從 0.01~20%(質量)，較佳為 0.05~10%(質量)

製成粒劑等時，從 0.1~30%(質量)，較佳為 0.5~20%(質量)

製成水合劑、顆粒水合劑等時，從 1~70%(質量)，較佳為 5~50%(質量)

製成水溶劑、液劑等時，從 1~95%(質量)，較佳為 10~80%(質量)

製成乳劑等時，從 5~90%(質量)，較佳為 10~80%(質量)
製成油劑等時，從 1~50%(質量)，較佳為 5~30%(質量)
製成水懸劑等時，從 5~60%(質量)，較佳為 10~50%(質量)

製成乳劑、微乳劑、懸乳劑等時，從 5~70%(質量)，
較佳為 10~60%(質量)

製成錠劑、噴劑、糊劑等時，從 1~80%(質量)，較佳
為 5~50%(質量)

製成薰煙劑等時，從 0.1~50%(質量)，較佳為 1~30%(質量)

製成氣溶劑等時，從 0.05~20%(質量)，較佳為
0.1~10%(質量)
之範圍適當選擇較佳。

此等製劑稀釋成適當濃度並散布，或直接施用。

本發明之有害生物防除劑施用時，以稀釋劑稀釋後使用時，一般係以 0.1~5000ppm 之有效成分濃度進行。製劑直接使用時，單位面積的施用量，就有效成分化合物而言，每 1ha 使用 0.1~5000g，但不限於此等。

又，本發明之有害生物防除劑，即使單獨使用本發明化合物當做有效成分當然已十分有效，但視需要可混用、併用其他肥料、農藥、例如殺蟲劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、協力劑、殺菌劑、抗病毒劑、誘引劑、除草劑、植物生長調整劑等，此情形有時會展現更好的效果。

可混合或併用的公知殺蟲劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、協

力劑化合物舉例如下。

1. 乙醯基膽鹼酯酶抑制劑：

(1A) 胺甲酸酯化合物：棉鈴威(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、艾地卡(aldoxycarb)、本地卡(bendiocarb)、免扶克(benfuracarb)、佈嘉信(butocarboxim)、氧佈嘉信(butoxycarboxim)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、愛芬克(ethiofencarb)、丁基滅必蝨(fenobucarb)、覆滅蟎(formetanate)、呋線威(furathiocarb)、滅必蝨(isoprocarb)、滅賜克(methiocarb)、納乃得(methomyl)、治滅蝨(metolcarb)、毆殺滅(oxamyl)、比加普(pirimicarb)、安丹(propoxur)、硫敵克(thiodicarb)、硫伐隆(thiofanox)、唑蚜威(triazamate)、混滅威(trimethacarb)、XMC(XMC)、滅爾蝨(xylylcarb)；

(1B) 有機磷化合物：毆殺松(acephate)、亞滅松(azamethiphos)、乙基谷硫磷(azinphos-ethyl)、甲基谷硫磷(azinphos-methyl)、硫線磷(cadusafos)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、毒蟲畏(chlorfenvinphos)、氯甲硫磷(chlormephos)、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、潤馬磷(coumaphos)、氰乃松(cyanophos)、滅賜松(demeton-S-methyl)、diamidafos、大利松(diazinon)、二氯松(dichlorvos)、雙特松(dicrotophos)、大滅松(dimethoate)、甲基毒蟲畏(dimethylvinphos)、殺力松(dioxabenzofos)、二硫松

(disulfoton)、DSP(DSP)、EPN、愛殺松(ethion)、普伏松(ethoprophos)、益多松(etrifos)、氯磷磷(famphur)、芬滅松(fenamiphos)、撲芬松(fenitrothion)、芬殺松(fenthion)、大福松(fonofos)、福賽絕(fosthiazate)、吉福松(fosthietan)、飛達松(heptenophos)、isamidofos、氯唑磷(isazophos)、甲基異柳磷(isofenphos-methyl)、0-(甲氧基胺基硫磷醯基)水楊酸異丙酯(isopropyl 0-(methoxyaminothio-phosphoryl) salicylate)、加福松(isoxathion)、馬拉松(malathion)、滅加松(mecarbam)、達馬松(methamidophos)、滅大松(methidathion)、美文松(mevinphos)、亞素靈(monocrotophos)、乃力松(naled)、歐滅松(omethoate)、滅多松(oxydemeton-methyl)、異亞磷(oxydeprofos)、巴拉松(parathion)、甲基巴拉松(parathion-methyl)、賽達松(phenthoate)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosalone)、益滅松(phosmet)、福賜米松(phosphamidon)、巴賽松(phoxim)、蟲蟎磷(pirimiphos-methyl)、佈飛松(profenofos)、加護松(propaphos)、胺丙畏(propetamphos)、普硫松(prothiofos)、白克松(pyraclofos)、必芬松(pyridaphenthion)、拜裕松(quinalphos)、治螟磷(sulfotep)、嘧丙磷(tebupirimfos)、亞培松(temephos)、托福松(terbufos)、殺蟲畏(tetrachlorvinphos)、硫滅松(thiometon)、治線磷(thionazin)、三落松(triazophos)、三氯松

(trichlorfon)、繁米松(vamidotion)、除線磷(dichlofenthion)、imicyafos、水胺硫磷(isocarbophos)、滅速芬(mesulfenfos)、芬普松(flupyrzofos)

2. GABA 受體(氯離子通道)抑制劑

(2A)環二烯有機氯系化合物:氯丹(chlordane)、安殺番(endosulfan)、gamma-BHC(gamma-BCH);

(2B)苯基吡唑系化合物:亞普洛(acetoprol)、益斯普(ethiprole)、芬普尼(fipronil)、帕普洛(pyrafluprole)、普洛(pyriprole)、RZI-02-003(代表編號)

3. 作用於鈉通道之藥劑

(3A)擬除蟲菊酯系化合物:阿納寧(acrinathrin)、亞烈寧(allethrin)[包含 d-順式-反式、d-反式]、畢芬寧(bifenthrin)、必拉特靈(bioallethrin)、S-環戊烯基必拉特靈(bioallethrin S-cyclopentenyl)、百列滅寧(bioresmethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)[包含 beta-型]、賽洛寧(cyhalothrin)[包含 gamma-、lambda-]、賽滅寧(cypermethrin)[包含 alpha-、beta-、theta-、zeta-]、賽酚寧(cyphenothrin)[包含 (1R)-反式異構物]、第滅寧(deltamethrin)、益避寧(empenthrin)、益化利(esfenvalerate)、依芬寧(etofenprox)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、護賽寧(flucythrinate)、氟氯苯菊酯

(flumethrin)、tau-fluvalinate [包含 tau -]、合芬寧 (halfenprox)、依普寧 (imiprothrin)、美特寧 (metofluthrin)、百滅寧 (permethrin)、酚丁滅寧 (phenothrin)[包含 (1R)-反式異構物]、普亞列寧 (prallethrin)、profluthrin、pyrethrine、列滅寧 (resmethrin)、RU15525(代碼編號)、矽護芬 (silafluofen)、特夫寧 (tefluthrin)、治滅寧 (tetramethrin)、泰滅寧 (tralomethrin)、四氟苯菊酯 (transfluthrin)、ZXI8901(代碼編號)、福化利 (fluvalinate)、tetramethylfluthrin、meperfluthrin;

(3B)DDT系化合物:DDT、甲氧基達(methoxychlor)

4. 尼古丁性乙醯基膽鹼受體致效劑/拮抗劑

(4A)類菸鹼(nicotinoid)系化合物: 亞滅培 (acetamiprid)、可尼丁(clothianidin)、達特南 (dinotefuran)、益達胺(imidacloprid)、烯啶蟲胺 (nitenpyram)、賽果培(thiacloprid)、賽速安 (thiamethoxam);

(4B)尼古丁系化合物:硫酸尼古丁(nicotine-sulfate)

5. 尼古丁性乙醯基膽鹼受體別構(allosteric)活化劑

Spinocin系化合物: 賜諾特(spinetoram)、賜諾殺 (spinosad);

6. 活化氯通道的藥劑

Avermectin、Milbemycin系化合物: 阿巴汀 (abamectin)、因滅汀(emamectin benzoate)、利滅克定

(lepimectin)、密滅汀(milbemectin)、ivermectin、polynactins

7. 類幼小荷爾蒙的藥劑劑

狄奧諾蘭(diofenolan)、hydroprene、kinoprene、methothrin、芬諾克(fenoxycarb)、百利普芬(pyriproxyfen)

8. 非專一性作用(多作用點)之藥劑

1,3-二氯丙烯(1,3-dichloropropene)、DCIP、乙二溴(ethylene dibromide)、甲基溴(methyl bromide)、chloropicrin、氟化硫(sulfuryl fluoride)

9. 攝食抑制劑

派滅淨(pymetrozine)、氟尼胺(flonicamid)、百利氟脞(pyrifluquinazon)

10. 蟎之成長制御劑

克芬蟎(clofentezine)、diflovidazin、合賽多(hexythiazox)、依殺蟎(etoxazole)

11. 破壞昆蟲腸內膜之藥劑

BT劑: *Bacillus sphaericus*、*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*、*Bacillus thuringiensis* subsp. *israelensis*、*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*、*Bacillus thuringiensis* subsp. *tenebrionis*、Bt crop proteins(Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1)、*Bacillus popilliae*、*Bacillus subtillis*

12. ATP 生合成酵素抑制劑

汰芬隆(diafenthiuron);

有機錫化合物：蟬離丹(azocyclotin)、三環錫(cyhexatin)、芬佈賜(fenbutatin oxide);

毆蟪多(propargite)、tetradifon

13. 脫共軛劑

克凡派(chlorfenapyr)、DNOC(DNOC)

14. 尼古丁性乙醯基膽鹼通道阻斷劑

Nereistoxin 系化合物：免速達(bensultap)、培丹(cartap)、硫賜安(thiocyclam)、硫速達鈉(thiosultap)

15. 幾丁質生合成抑制劑(0 型)

苯甲醯基脲系化合物：雙三氟蟲脲((bistrifluron)、克福隆(chlorfluazuron)、二福隆(diflubenzuron)、氟環脲(flucycloxuron)、氟芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、祿芬隆(lufenuron)、諾伐隆(novaluron)、多氟蟲醯脲(noviflumuron)、得福隆(teflubenzuron)、三福隆(triflumuron)、克福隆(fluzuron)

16. 幾丁質生合成抑制劑(1 型)

布芬淨(buprofezin)

17. 脫皮抑制劑(雙翅目對象)

賽滅淨(cyromazine)

18. 蛻皮激素(Ecdysone)致效劑(脫皮促進)

二醯基脒系化合物：可芬諾(chromafenozide)、氯醯

肼(halofenozide)、滅芬諾(methoxyfenozide)、得芬諾(tebufenozide);

19. 章魚胺(Octopamine)致效劑

三亞蟎(amitraz)

20. 粒腺體電子傳遞系(複合體 III)抑制劑

賽芬蟎(cyflumetofen)、愛美松(hydramethylnon)、亞醯蟎(acequinocyl)、fluacrypyrim、cyenopyrafen

21. 粒腺體電子傳遞系(複合體 I)抑制劑

METI 殺蟎劑：芬殺蟎(fenazaquin)、芬普蟎(fenpyroximate)、畢達本(pyridaben)、畢汰芬(pyrimidifen)、得芬瑞(tebufenpyrad)、脫芬瑞(tolfenpyrad);

其他：魚藤精(rotenone)

22. 鈉通道抑制劑

因得克(indoxacarb)、美氟綜(metaflumizon)

23. 脂質生合成抑制劑

tetranic 系殺蟲 / 殺蟎劑：賜派芬(spirodiclofen)、螺甲蟎酯(spiromesifen)、賜派滅(spirotetramat)

24. 粒腺體電子傳遞系(複合體 IV)抑制劑

磷化鋁(aluminium phosphide)、磷化氫(phosphine)、磷化鋅(zinc phosphide)、氰化鈣(calcium cyanide)

25. 神經抑制(作用機轉不明)劑

必芬蟎(bifenazate)

26. 烏頭酸酶抑制劑

氟乙酸鈉鹽(sodium fluoroacetate)

27. 共效劑

胡椒基丁醚(piperonyl butoxide)、DEF(DEF)

28. 對於雷阿諾定(ryanodine)受體作用之藥劑

剋安勃(chlorantraniliprole)、氟大滅
(flubendiamide)、cyantraniliprole

29. 其他(作用性不明)之藥劑

印楝素(azadirachtin)、amidoflumet、benclothiaz、
西脫蟎(benzoximate)、新殺蟎(bromopropylate)、蟎離丹
(chinomethionat)、CL900167(代碼編號)、氟鋁酸鈉
(cryolite)、大克蟎(dicofol)、地昔尼爾(dicyclanil)、
得氯蟎(dienochlor)、大脫蟎(dinobuton)、芬佈賜
(fenbutatin oxide)、芬硫克(fenothiocarb)、
fluensulfone、flufenerim、氟硫滅(flusulfamide)、
karanjin、斯美地(metham)、美賜平(methoprene)、滅芬
諾(methoxyfenozide)、異硫氰酸甲酯(methyl
isothiocyanate)、pyridalyl、pyrifluquinazon、
sulcofuron-sodium、氟蟲胺(sulfluramid)、sulfoxaflor

30. 昆蟲病原性絲狀菌、殺線蟲微生物

白殭菌(Beauveria bassiana)、Beauveria tenella、蚺輪
枝菌(Verticillium lecanii)、Pacilimyces tenuipes、
玫煙色擬青黴(Paecilomyces fumosorocceus)、Beauveria

brongniartii、Monacrosporium phymatophagum、穿刺芽
孢桿菌孢子(Pasteuriapenetrans)

31. 性費洛蒙

(Z)-11-十六烷烯醛、(Z)-11-十六烯=乙酸酯、
liltlure-A、liltlure-B、Z-13-二十烯-10-酮、(Z,E)-9,12-
十四基二烯=乙酸酯、(Z)-9-十四烯-1-醇、(Z)-11-十四
烯基=乙酸酯、(Z)-9,12-十四基二烯=乙酸酯、
(Z,E)-9,11-十四基二烯=乙酸酯

以下列舉可混合或併用之公知之殺菌劑或病害防除劑
化合物。

1. 核酸生合成抑制劑

鹽基丙胺酸化合物：本達樂(benalaxyl)、本達樂·
M(benalaxyl-M)、furalaxyl、滅達樂(metalaxyl)、滅達
樂·M(metalaxyl-M)；

噁唑烷酮系化合物：毆殺斯(oxadixyl)；

丁內酯系化合物：clozylacon、ofurace；

羥基-(2-胺基)嘧啶系化合物：布瑞莫
(bupirimate)、dimethirimol、依瑞莫(ethirimol)；

異噁唑系化合物：殺紋寧(hymexazol)；

異二氫噻唑酮系化合物：octhilinone；

羧酸系化合物：歐索林酸(oxolinic acid)

2. 有絲分裂及細胞分裂抑制劑

苯并咪唑系化合物：免賴得(benomyl)、貝芬替
(carbendazim)、fuberidazole、腐絕(thiabendazole)；

多保淨系化合物：多保淨(thiophanate)、甲基多保淨(thiophanate-methyl)；

N-苯基胺甲酸酯系化合物：diethofencarb；

甲苯醯胺系化合物：座賽胺(zoxamide)；

苯基脲系化合物：賓克隆(pencycuron)；

吡啶基甲基苯甲醯胺系化合物：氟比來(fluopicolide)

3. 呼吸抑制劑

嘧啶胺系化合物：二氟林(diflumetorim)；

羧醯胺系化合物：麥鏽靈(benodanil)、福多寧(flutolanil)、滅普寧(mepronil)、fluopyram、甲呋醯胺(fenfuram)、嘉保信(carboxin)、嘉保信(oxycarboxin)、賽氟滅(thifluzamide)、bixafen、福拉比(furametpyr)、isopyrazam、penflufen、penthioapyrad、sedaxane、白克列(boscalid)；

甲氧基丙烯酸酯系化合物：亞托敏(azoxystrobin)、烯肱菌酯(enestroburin)、右本達樂(picoxystrobin)、pyraoxystrobin；

甲氧基胺甲酸酯系化合物：百克敏(pyraclostrobin)、pyrametostrobin；

羥基亞胺基乙酸酯化合物：克收欣(kresoxim-methyl)、三氟敏(trifloxystrobin)；

羥基亞胺基乙醯胺系化合物：醚菌胺(dimoxystrobin)、苯氧菌胺(metominostrobin)、肱醚菌

胺(orysastrobin);

噁唑烷二酮系化合物: 凡殺同(famoxadone);

二氫二噁唑啉系化合物: 氟嘧菌酯(fluoxastrobin);

咪唑啉酮系化合物: 咪唑菌酮(fenamidone);

苄基胺甲酸酯系化合物: 吡菌苯威(pyribencarb);

氰基咪唑系化合物: 賽座滅(cyazofamid);

胺磺鹽基三唑系化合物: 安美速(amisulbrom);

二硝基苯基巴豆酸系化合物: 百蟎克(binapacryl)、消蟎多(meptyldinocap)、敵蟎普(dinocap);

2,6-二硝基苯胺系化合物: 扶吉胺(fluazinam);

嘧啶酮脲系化合物: 富米綜(ferimzone);

三苯基錫系化合物: TPTA(TPTA)、TPTC(TPTC)、TPTH(TPTH);

噻吩羧醯胺系化合物: 矽噻菌胺(silthiofam);

三唑并嘧啶胺系化合物: ametoctradin

4. 胺基酸及蛋白質合成抑制劑

苯胺基嘧啶系化合物: 賽普洛(cyprodinil)、滅派林(mepanipirim)、派美尼(pyrimethanil);

吡喃糖醛酸(enopyranuronic acid)系抗生物質: 保米黴素-S(blasticidin-S)、米多黴素(mildiomycin);

六碳吡喃糖系抗生物質: 嘉賜黴素(kasugamycin);

葡糖吡喃糖系抗生物質: 鏈黴素(streptomycin);

四環黴素系抗生物質: 羥四環素(oxytetracycline)

5. 對於信號傳遞系作用之藥劑

喹啉系化合物：快諾芬(quinoxyfen);

喹唑啉系化合物：碘喹唑酮(proquinazid);

苯基吡咯系化合物：拌種咯(fenpiclonil)、護汰寧(fludioxonil);

二羧基醯胺系化合物：克氯得(chlozolate)、依普同(iprodione)、撲滅寧(procymidone)、免克寧(vinclozolin);

6. 脂質及細胞膜合成抑制劑

硫磷酸酯系化合物：護粒松(edifenphos)、丙基喜樂松(iprobenfos)、白粉松(pyrazophos);

dithiolane系化合物：亞賜圃(isoprothiolane);

芳香族烴系化合物：聯苯(biphenyl)、地茂散(chloroneb)、大克爛(dicloran)、五氯硝基苯(quintozene)、四氯硝基苯(tecnazene)、脫克松(tolclofos-methyl);

1,2,4-噻二唑系化合物：依得利(etridiazole);

胺甲酸酯系化合物：iodocarb、普拔克(propamocarb-hydrochloride)、prothiocarb;

桂皮酸醯胺系化合物：達滅芬(dimethomorph)、氟嗎啉(flumorph);

戊醯胺胺甲酸酯系化合物：苯菌胺(benthiavalicarb-isopropyl)、顯霉威(iprovalicarb)、valifenalate;

杏仁酸醯胺系化合物：曼普胺(mandipropamid);

枯草桿菌及殺菌性核糖胜肽生產物：枯草桿菌
(*Bacillus subtilis*)(菌株:QST 713)

7. 固醇合成抑制劑

哌咁系化合物：賽福寧(triforine);

吡啉系化合物：比芬諾(pyrifenox);

噻啉系化合物：芬瑞莫(fenarimol)、尼瑞莫
(nuarimol);

咪唑系化合物：依滅列(imazalil)、惡咪唑富馬酸鹽
(oxpoconazole-fumarate)、披扶座(pefurazoate)、撲克
拉(prochloraz)、賽福座(triflumizole);

三唑系化合物：氧環唑(azaconazole)、比多農
(bitertanol)、溴克座(bromuconazole)、環克座
(cyproconazole)、待克利(difenoconazole)、達克利
(diniconazole)、達克利·M(diniconazole-M)、依普座
(epoxiconazole)、乙環唑(etaconazole)、芬克座
(fenbuconazole)、氟喹唑(fluquinconazole)、護矽得
(flusilazole)、護汰芬(flutriafol)、菲克利
(hexaconazole)、易胺座(imibenconazole)、種菌唑
(ipconazole)、滅特座(metconazole)、邁克尼
(myclobutanil)、平克座(penconazole)、普克利
(propiconazole)、prothioconazole、simeconazole、得
克利(tebuconazole)、四克利(tetraconazole)、三泰芬
(triadimefon)、三泰隆(triadimenol)、triticonazole、
呋菌唑(furconazole)、furconazole -cis、quinconazole;

嗎啉系化合物:aldimorph、嗎菌靈(dodemorph)、芬普福(fenpropimorph)、三得芬(tridemorph);

哌啶系化合物: 苯鏽啶苯鏽啶(fenpropidin)、粉病靈(piperalin);

螺縮醛胺系化合物: 螺環菌胺(spiroxamine);

羥基苯胺化物系化合物: 環鹽菌胺(fenhexamid);

硫胺甲酸酯系化合物: 稗草丹(pyributicarb);

烯丙胺系化合物:naftifine、terbinafine

8. 葡聚糖合成抑制劑

葡糖吡喃糖系抗生物質: 維利黴素(validamycin);

胍基吡啶核苷酸化合物: 保粒黴素(polyoxin)

9. 褪黑激素合成抑制劑

異苯并呋喃酮系化合物: 熱必斯(phthalide);

吡咯并喹啉系化合物:百快隆(pyroquilon);

三唑并苯并噻唑系化合物: 三賽唑(tricyclazole);

羧鹽胺系化合物: 加普胺(carpropamid)、雙氯氰菌胺(diclocymet);

丙鹽胺系化合物: 芬諾尼(fenoxanil)

10. 誘導植物病害抵抗性之藥劑

苯并噻二唑系化合物: acibenzolar-S-methyl;

苯并異噻唑系化合物: 撲殺熱(probenazole);

噻二唑羧鹽胺系化合物: 噻鹽菌胺(tiadinil)、isotianil;

天然物: 昆布多醣(Laminarin)

11. 作用性不明及多作用點之藥劑

銅化合物：氫氧化銅(II)(copper hydroxide)、辛酸銅(copper dioctanoate)、鹼性氯化銅(copper oxychloride)、硫酸銅(copper sulfate)、氧化銅(I)(cuprous oxide)、羥基喹啉銅(oxine-copper)、波爾多液(Bordeaux mixture)、壬基酚磺酸銅(copper nonyl phenol sulphonate);

硫化合物：硫(sulfur);

二硫代胺甲酸酯系化合物：富爾邦(ferbam)、鋅錳乃浦(mancozeb)、錳乃浦(maneb)、免得爛(metiram)、甲基鋅乃浦(propineb)、得恩地(thiram)、代森鋅(zineb)、福美鋅(ziram)、cufraneb;

鄰苯二甲醯亞胺系化合物：蓋普丹(captan)、滅菌丹(folpet)、四氯丹(captafol);

氯腈系化合物：四氯異苯腈(chlorothalonil);

硫醯胺系化合物：益發靈(dichlofluanid)、甲基益發靈(tolyfluanid);

胍系化合物：克熱淨(guazatine)、克熱淨(烷苯磺酸鹽)(iminoctadine-albesilate)、克熱淨乙酸鹽(iminoctadine-triacetate)、多寧(dodine);

其他化合物：敵菌靈(anilazine)、腈硫醯(dithianon)、克絕(cymoxanil)、福賽得(fosetyl)(鋁、鈣、鈉)、亞磷酸及鹽(phosphorous acid and salts)、克枯爛(tecloftalam)、咪唑嗪(triazoxide)、氟硫滅

(flusulfamide)、達滅淨(diclomezine)、滅速克(methasulfocarb)、噻唑菌胺(ethaboxam)、賽芬胺(cyflufenamid)、滅芬農(metrafenone)、碳酸氫鉀(potassium bicarbonate)、碳酸氫鈉(sodium bicarbonate)、BAF-045(代碼編號)、BAG-010(代碼編號)、佈生(benthiazole)、bronopol、香芹酮(carvone)、螞離丹(chinomethionat)、邁隆(dazomet)、DBEDC(DBEDC)、咪菌威(debacarb)、雙氯酚(dichlorophen)、燕麥枯(difenzoquat-methyl sulfate)、二甲基二硫(dimethyl disulfide)、二苯基胺(diphenylamine)、ethoxyquin、flumetover、fluoroimide、福多寧(flutianil)、fluxapyroxad、呋喃羧酸(furancarboxylic acid)、metam、代森鈉(nabam)、納他黴素(natamycin)、氯啉(nitrapyrin)、nitrothal-isopropyl、鄰苯基酚(o-phenylphenol)、oxazinylazole、硫酸羥基喹啉(oxyquinoline sulfate)、啡吡氧化物(phenazine oxide)、聚胺基甲酸酯(polycarbamate)、pyriofenone、S-2188(代碼編號)、銀(silver)、SYP-Z-048(代碼編號)、tebufloquin、tolnifanide、trichlamide、礦物油(mineral oils)、有機油(organic oils);

可混合或併用之公知之除草劑化合物、植物成長調整劑化合物，例如以下所示。

A1. 乙醯基 CoA 羧解酶(ACCase)抑制型除草劑

(A1-1) 芳氧基苯氧基丙酸系化合物: clodinafop-

propargyl、丁基賽伏草(cyhalofop-butyl)、diclofop-methyl、diclofop-P-methyl、fenoxaprop-P-ethyl、芬殺草(fluazifop-butyl)、芬殺草·P(fluazifop-P-butyl)、haloxyfop、haloxyfop-etotyl、合氯氟·P(haloxyfop-P)、惡唑草胺(metamifop)、普拔草(propaquizafop)、快伏草(quizalofop-ethyl)、快伏草·P(quizalofop-P-ethyl)、quizalofop-P-tefuryl、fenthiaprop-ethyl;

(A1-2)環己烷二酮系化合物：亞汰草(alloxydim)、丁苯草酮(butroxydim)、剋草同(clethodim)、環殺草(cycloxydim)、profoxydim、西殺草(sethoxydim)、得殺草(tepraloxym)、肱草酮(tralkoxydim);

(A1-3)苯基吡唑啉系化合物：aminopyralid、pinoxaden;

B. 乙醯乳酸合成酵素(ALS)抑制型除草劑

(B-1)咪唑啉酮系化合物：咪草酸(imazamethabenz-methyl)、imazamox、imazapic(含與胺等之鹽)、依滅草(imazapyr)(含異丙基胺等鹽)、imazaquin、咪草煙(imazethapyr);

(B-2)嘧啶氧基苯甲酸系化合物：bispyribac-sodium、嘧啶草醚(pyribenzoxim)、環酯草醚(pyriftalid)、嘧草醚(pyriminobac-methyl)、pyrithiobac-sodium、pyrimisulfan;

(B-3)磺醯基胺基羧基三唑啉酮系化合物：氟酮磺隆·鈉鹽(flucarbazone-sodium)、thiencarbazone(含鈉鹽、甲酯等)、丙苯磺隆(propoxycarbazone-sodium)、丙苯磺隆

鈉鹽 (procarbazon-sodium);

(B-4) 磺醯基脲系化合物：磺嘧磺隆 (amidosulfuron)、四唑嘧磺隆 (azimsulfuron)、免速隆 (bensulfuron-methyl)、禾草氯嘧磺隆 (chlorimuron-ethyl)、綠磺隆 (chlorsulfuron)、西速隆 (cinosulfuron)、環磺隆 (cyclosulfamuron)、胺苯磺隆 (ethametsulfuron-methyl)、亞速隆 (ethoxysulfuron)、伏速隆 (flazasulfuron)、氟吡嘧磺隆 (flupyr-sulfuron-methyl-sodium)、甲胺磺隆 (foramsulfuron)、甲基合速隆 (halosulfuron-methyl)、依速隆 (imazosulfuron)、iodosulfuron-methyl-sodium、mesosulfuron-methyl、(thifensulfuron-methyl、醚苯磺隆 (triasulfuron)、苯磺隆 (tribenuron-methyl)、trifloxysulfuron-sodium、氟胺磺隆 (triflusulfuron-methyl)、三氟甲磺隆 (tritosulfuron)、orthosulfamuron、咪唑嘧磺隆 (propyrisulfuron)、雙醚氯吡嘧磺隆 (metazosulfuron)、氟吡磺隆 (flucetosulfuron);

(B-5) 三唑並嘧啶系化合物：氯酯磺草胺 (cloransulam-methyl)、雙氯磺草胺 (diclosulam)、雙氯磺草胺 (florasulam)、唑嘧磺草胺 (flumetsulam)、磺草唑胺 (metosulam)、平速爛 (penoxsulam)、甲氧磺草胺 (pyroxsulam);

C1. 於光化學系 II (Photosystem II) 之光合成抑制除草劑 1

(C1-1) 苯基胺基甲酸酯系除化合物：雙苯胺靈

(desmedipham)、甜安寧(phenmedipham);

(C1-2) 嗒吡酮系化合物：殺草敏(chloridazon)、溴莠敏(brompyrazon);

(C1-3) 三吡系化合物：草殺淨(amestryne)、草脫淨(atrazine)、氰草津(cyanazine)、desmetryne、愛落殺(dimethametryn)、eglinazine-ethyl、撲滅通(prometon)、佈殺丹(prometryn)、普拔根(propazine)、草滅淨(simazine)、西草淨(simetryn)、甲氧去草淨(terbumeton)、草淨津(terbuthylazine)、去草淨(terbutryn)、草達津(trietazine);

(C1-4) 三吡酮系化合物：苯草酮(metamitron)、滅必淨(metribuzin);

(C1-5) 三唑啉酮系化合物：氨唑草酮(amicarbazone);

(C1-6) 尿嘧啶系化合物：克草(bromacil)、環草定(lenacil)、特草定(terbacil);

C2. 於光化學系 II(Photosystem II)之光合成抑制除草劑 2

(C2-1) 醯胺系化合物：甲氯草胺(pentanochlor)、除草靈(propanil);

(C2-2) 尿素系化合物：滅落寧(chlorbromuron)、綠麥隆(chlorotoluron)、枯草隆(chloroxuron)、惡唑隆(dimefuron)、達有龍(diuron)、磺噻隆(ethidimuron)、祿芬隆(fenuron)、伏草隆(fluometuron)、異丙隆(isoproturon)、愛速隆(isouron)、理有龍(linuron)、甲基苯隆(methabenzthiazuron)、撲奪草(metobromuron)、

甲氧隆 (metoxuron)、綠谷隆 (monolinuron)、草不隆 (neburon)、環草隆 (siduron)、丁隆 (tebuthiuron)、吡喃隆 (metobenzuron);

C3. 於光化學系 II (Photosystem II) 之光合成抑制除草劑 3

(C3-1) benzothiadizone 系化合物: 本達隆 (bentazone);

(C3-2) 腈系化合物: 溴芬辛 (bromofenoxim)、溴尼 (bromoxynil) (包含丁酸、辛酸或庚酸等酯體)、碘尼 (ioxynil);

(C3-3) 苯基吡啶系除草性化合物: 必達伏 (pyridafol)、必汰草 (pyridate);

D. 從光化學系 I 而來之自由基生成型除草性劑

(D-1) 聯吡啶鎰系化合物: 汰克 (diquat)、巴拉刈二氯鹽 (paraquat dichloride);

E. PPO 抑制型除草劑

(E-1) 二苯醚系化合物: 亞喜芬 (acifluorfen-sodium)、必芬諾 (bifenox)、克喜芬 (chlomethoxyfen)、滅芬諾 (ethoxyfen-ethyl)、乙羧氟草醚 (fluoroglycofen-ethyl)、伏賽芬 (fomesafen)、拉特芬 (lactofen)、歐伏芬 (oxyfluorfen);

(E-2) N-苯基鄰苯二甲醯亞胺系化合物: 乙基酮草酯 (cinidon-ethyl)、戊基氟烯草酸 (flumiclorac-pentyl)、丙炔氟草胺 (flumioxazin)、氯代苯二酸 (chlorphthalim);

(E-3) 羰基二唑系化合物: 丙炔惡草酮 (oxadiargyl)、樂滅草 (oxadiazon);

(E-4) 噁唑啉二酮系化合物：本特松(pentoxazone)；

(E-5) 苯基吡唑系化合物：伏索烈(fluazolate)、乙基派芬草(pyraflufen-ethyl)；

(E-6) 噻啉二酮系化合物：雙苯噻草酮(benzfendizone)、氟丙噻草酯(butafenacil)、噻啉肟草醚(saflufenacil)；

(E-7) 噻二唑系化合物：甲基氟乙草酯(fluthiacet-methyl)、thidiazimin；

(E-8) 三唑啉酮系化合物：草芬定(azafenidin)、乙基克繁草(carfentrazone-ethyl)、甲磺草胺(sulfentrazone)、bencarbazone；

(E-9) 其他化合物：乙基氟噻草酯(flufenpyr-ethyl)、氟唑草胺(profluazol)、雙唑草腈(pyraclonil)、SYP-298(代碼編號)、SYP-300(代碼編號)；

F1. PDS 抑制劑除草劑

(F1-1) 嗒吡啉酮系化合物：達草滅(norflurazon)；

(F1-2) 噻啉羧醯胺系化合物：吡氟醯草胺(diflufenican)、氟吡醯草胺(picolinafen)；

(F1-3) 其他化合物：

氟丁草胺(beflubutamid)、氟啉草酮(fluridone)、氟咯草酮(flurochloridone)、呋草酮(flurtamone)；

F2. 4-羥基苯基丙酮酸二加氧酶(HPPD)抑制型除草劑

(F2-1) Callistemon 系化合物：甲基磺草酮(mesotrione)；

(F2-2) 異噁唑系化合物：匹索氟脫(pyrasulfotole)、異惡唑草酮(isoxaflutole)、isoxachlortol)；

(F2-3) 吡唑系化合物：吡草酮 (benzofenap)、苜草唑 (pyrazolynate)、匹唑芬 (pyrazoxyfen);

(F2-4) 三酮系化合物：磺草酮 (sulcotrione)、特氟曲酮 (tefuryltrion)、替伯曲酮 (tembotrione)、匹索氟脫 (pyrasulfotole)、吡草磺 (topramezone)、二環吡酮 (bicyclopypyrone);

F3. 類胡蘿蔔素生合成抑制劑(標的未知)除草劑

(F3-1) 二苯醚系化合物：苯草醚 (aclonifen);

(F3-2) 異噁唑啉啉酮系化合物：可滅蹤 (clomazone);

(F3-3) 三唑系化合物：殺草強 (amitrole);

G. EPSP 合成酶合成抑制(芳香族胺基酸生合成抑制)型除草劑

(G-1) 甘胺酸系化合物：嘉磷塞 (glyphosate)(包含鈉、胺、丙基胺、異丙基胺、二甲基胺或三甲基硫鹽等鹽);

H. 麩醯胺酸合成抑制劑除草劑

(H-1) 膦酸系化合物：畢拉草 (bilanafos)、草丁膦 (glufosinate)(包含胺或鈉等鹽);

I. DHP 抑制劑除草劑

(I-1) 胺甲酸酯系化合物：磺草靈 (asulam);

K1. 微小管之集合抑制型除草性劑

(K1-1) 苯甲醯胺系化合物：炔苯醯草胺 (propyzamide)、牧草胺 (tebutam);

(K1-2) 苯甲酸系化合物：敵草索 (chlorthal-dimethyl)

(K1-3) 二硝基苯胺系化合物：倍尼芬 (benfluralin)、地禾

安 (butralin)、撻乃安 (dinitramine)、丁氟消草 (ethalfluralin)、貝殺寧 (fluchloralin)、歐拉靈 (oryzalin)、施得圃 (pendimethalin)、胺氟樂靈 (prodiamine)、三福林 (trifluralin);

(K1-4)偶磷基甲脒鹽系化合物:amiprofos-methyl、丁胺磷 (butamifos);

(K1-5)吡啶系化合物:汰硫草 (dithiopyr)、噻草啞 (thiazopyr);

K2. 有絲分裂/微小管組織形成抑制型除草劑

(K2-1)胺甲酸酯系化合物:草長滅 (carbetamide)、克普凡 (chlorpropham)、普凡 (propham)、滅草靈 (swep)、特胺靈 (karbutilate);

K3. 超長鏈脂肪酸伸長酵素(VLCFA)抑制型除草劑

(K3-1)乙醯胺系化合物:達芬滅 (diphenamid)、萘普醯胺 (napropamide)、萘普醯替苯胺 (naproanilide);

(K3-2)氯乙醯胺系化合物:乙醯拉草 (acetochlor)、拉草 (alachlor)、丁基拉草 (butachlor)、丁基拉草 (butenachlor)、乙醯甲草胺 (diethyl-ethyl)、二甲基拉草 (dimethachlor)、大滅醯胺 (dimethenamid)、大滅醯胺 · P (dimethenamid-P)、滅克 (metazachlor)、滅多草 (metolachlor)、烯草胺 (pethoxamid)、普特拉草 (pretilachlor)、雷蒙得 (propachlor)、普克 (propisochlor)、S-莫多草 (S-metolachlor)、殺克 (thenylchlor);

(K3-3) 羥基乙醯胺系化合物：伏芬賽(flufenacet)、美納特(mefenacet);

(K3-4) Tetradrinone 系化合物：芬賽醯胺(fentrazamide);

(K3-5) 其他化合物：安力伏(anilofos)、溴汰(bromobutide)、唑草胺(cafenstrole)、節草酮(indanofan)、拜伏斯(piperophos)、fenoxasulfone、派羅克殺草磺(pyroxasulfone)、鹵苯胺唑(ipfencarbazone);

L. 纖維素合成抑制劑除草劑

(L-1) 苯甲醯胺系化合物：異惡草胺(isoxaben);

(L-2) 脞系化合物：敵草脞(dichlobenil)、草克樂(chlorthiamid);

(L-3) 三唑并羧醯胺系化合物：flupoxam;

M. 脫共軛劑(細胞膜破裂)型除草劑

(M-1) 二硝基酚系化合物：特樂酚(dinoterb)、DNOC(含胺或鈉等鹽);

N. 脂質生合成(ACCase 抑制以外)抑制型除草劑

(N-1) 苯并呋喃系化合物：呋草黃(benfuresate)、乙氧呋草黃(ethofumesate);

(N-2) 鹵化羧酸系化合物：茅草枯(dalapon)、氟丙酸(flupropanate)、TCA(含鈉、鈣或氫等鹽);

(N-3) 二硫酸偶磷酯系化合物：地散磷(bensulide);

(N-4) 硫胺甲酸酯系化合物：butylate、環草特(cycloate)、哌草丹(dimepiperate)、EPTC、戊草丹(esprocarb)、稻得壯(molinate)、坪草丹(orbencarb)、

克草敵(pebulate)、苄草丹(prosulfocarb)、殺丹(thiobencarb)、仲草丹(tiocarbazil)、野燕畏(tri-
allate)、滅草敵(vernolate);

0. 合成生長素型除草劑

(0-1) 苯甲酸系化合物：豆科畏(chloramben)、2,3,6-TBA、汰克草(dicamba)(含胺、二乙胺、異丙胺、二甘醇胺、
鈉或鋰等鹽);

(0-2) 苯氧基羧酸系化合物：2,4,5-T、2,4-D(含胺、二乙基
胺、三乙醇胺、異丙胺、鈉或鋰等鹽)、2,4-DB、克普草
(clomeprop)、滴丙酸(dichlorprop)、滴丙酸-P
(dichlorprop-P)、MCPA、MCPA·硫代乙酯(MCPA-
thioethyl)、MCPB(含鈉鹽、乙酯等)、甲氯丙酸
(mecoprop)(含鈉、鉀、異丙基胺、三乙醇胺、二甲胺等鹽)、
甲氯丙酸-P·鉀鹽(mecoprop-P);

(0-3) 吡啶羧酸系化合物：畢克草(clopyralid)、氟氯比
(fluroxypyr)、picloram、三氯比(triclopyr)、三氯比
(triclopyr-butotyl);

(0-4) 喹啉羧酸系化合物：快克草(quinclorac)、氯甲酸
(quinmerac);

(0-5) 其他化合物：草除靈(benazolin);

P. 生長素輸送抑制型除草劑

(P-1) 鄰苯二甲酸酯(Phthalamates)系化合物：鈉得爛
(naptalam)(包含與鈉等之鹽);

(P-2) 半卡巴脲系化合物：二氟吡隆(diflufenzopyr);

Z. 作用性未知之除草劑

麥草氈 · M(flamprop-M)(包含甲酯、乙酯、異丙酯)、
 麥草氈(flamprop)(包含甲酯、乙酯、異丙酯)、整形醇
 (chlorflurenol-methyl)、環庚草醚(cinmethylin)、苄草
 隆(cumyluron)、殺草隆(daimuron)、甲基殺草隆
 (methyldymuron)、雙苯唑快(difenzoquat)、乙氧苯草胺
 (etobenzanid)、殺木磷(fosamine)、稗草丹
 (pyributicarb)、惡草酮(oxaziclomefone)、丙烯醛
 (acrolein)、AE-F-150944(代碼編號)、胺環吡克
 (aminocyclopyrachlor)、氰滿素(cyanamide)、
 heptamaloxyloglucan、indaziflam、三唑他
 (triaziflam)、莫克草(quinoclamine)、茵多酸二鈉鹽
 (endothal-disodium)、棉胺寧(phenisopham)

植物生長調節劑：1-甲基環丙烯(1-methylcyclopropene)、1-萘基乙醯胺(1-naphthylacetamide)、2,6-二異丙基萘(2,6-diisopropyl naphthalene)、4-CPA、苄基胺基嘌呤(benzylaminopurine)、嘧啶醇(ancymidol)、aviglycine、香荊芥酮(carvone)、矮壯素(chlormequat)、調果酸(cloprop)、座果酸(cloxyfonac)、座果酸鉀鹽(cloxyfonac-potassium)、環丙草胺(cyclanilide)、細胞分裂素(cytokinins)、亞拉生長素(daminozide)、敵草克(dikegulac)、穫萎得(dimethipin)、乙烯利(ethephon)、吲熟酯(ethychlozate)、氟節胺(flumetralin)、抑草丁

(flurenol)、呋嘧醇(flurprimidol)、福芬素(forchlorfenuron)、吉貝素(gibberellin acid)、依納素(inabenfide)、吲哚乙酸(indole acetic acid)、吲哚丁酸(indole butyric acid)、馬來酸醯肼(maleic hydrazide)、美福泰(mefluidide)、縮節胺(mepiquat chloride)、癸醇(n-decanol)、巴克素(paclobutrazol)、調環酸鈣(prohexadione-calcium)、茉莉酸丙酯(prohydrojasmon)、殺雄啉(sintofen)、噻苯隆(thidiazuron)、三十烷醇(triacontanol)、乙基抗倒酯(trinexapac-ethyl)、單克素(uniconazole)、單克素-P(uniconazole-P)。

以下列舉可混合或併用之公知之藥害減輕化合物。

解草嗪(benoxacor)、解草惡唑(furilazole)、二氯丙烯胺(dichlormid)、dicyclonone、DKA-24(N1,N2-二烯丙基-N2-二氯乙醯基甘胺醯胺)、AD-67(4-二氯乙醯基-1-氧雜-4-氮雜螺[4.5]癸烷)、PPG-1292(2,2-二氯-N-(1,3-二噁烷-2-基甲基)-N-(2-丙烯基)乙醯胺)、R-29148(3-二氯乙醯基-2,2,5-三甲基-1,3-氧雜噁唑啉)、cloquintcet-mexyl、萘二甲酸酐(1,8-Naphthalic Anhydride)、美芬派-二乙酯(mefenpyr-diethyl)、美芬派(mefenpyr)、美芬派乙酯(mefenpyr-ethyl)、解草唑-乙酯(fenchlorazole O ethyl)、解草啉(fenclorim)、MG-191(2-二氯甲基-2-甲基-1,3-二噁烷)、解草胺(cyometrinil)、解草安(flurazole)、氟草肼(fluxofenim)、異地芬

(isoxadifen)、乙基異地芬(isoxadifen-ethyl)、mecoprop、MCPA、殺草隆(daimuron)、2,4-D、MON4660(代碼編號)、解草腈(oxabetrinil)、cyprosulfamide、及TI-35(代碼編號)。

本發明中當做對象的有害生物，係指：直翅目害蟲、薊馬目害蟲、半翅目害蟲、鞘翅目害蟲、雙翅目害蟲、鱗翅目害蟲、膜翅目害蟲、彈尾目害蟲、衣魚目害蟲、蜚蠊目害蟲、白蟻目害蟲、嚙蟲目害蟲、葉虱目害蟲、虱目害蟲、植物寄生性蠕類、植物寄生性線蟲類、植物寄生性軟體動物、其他有害動物、不快動物、衛生害蟲、寄生蟲等。如此的有害生物，例如以下的生物種類。

直翅目害蟲，例如蝻蜚科之黑頸鉤額草蝻(*Ruspolia lineosa*)等、蟋蟀科之田蟋蟀(*Teleogryllus emma*)等、螻蛄科之東方螻蛄(*Gryllotalpa orientalis*)、蝗科之小稻蝗(*Oxya hyla intricate*)、東亞飛蝗/亞洲飛蝗(*Locusta migratoria*)、遷徙蚱蜢(*Melanoplus sanguinipes*)等、負蝗科之負蝗(*Atractomorpha lata*)、叢蟋科之 *Euscyrtus japonicus*、蚤螻科之蚤螻(*Xya japonicus*)等。

薊馬目害蟲，例如薊馬科之台灣薊馬(*Frankliniella intonsa*)、苜蓿薊馬(*Frankliniella occidentalis*)、茶黃薊馬(*Scirtothrips dorsalis*)、棕櫚薊馬(*Thrips palmi*)、烟草薊馬(*Thrips tabaci*)等、管薊馬科之花細薊馬(*Ponticulothrips diospyrosi*)、稻管薊馬(*Haplothrips aculeatus*)等。

半翅目害蟲，例如蟬科之 *Mogannia minuta* 等、尖胸沫蟬科之白條沫蟬 (*Aphrophora intermedia*) 等、角蟬科之褐角蟬 (*Machaerotypus sibiricus*) 等、葉蟬科之 *Arboridia apicalis*、茶綠姬浮塵子 (*Empoasca onukii*)、黑尾浮塵子 (*Nephotettix cincticeps*)、電光浮塵子 (*Recilia dorsalis*) 等、菱飛蝨科之 *Pentastiridius apicalis* 等、飛蝨科之稻斑飛蝨 (*Laodelphax striatellus*)、稻褐飛蝨 (*Nilaparvata lugens*)、稻白背飛蝨 (*Sogatella furcifera*) 等、縞飛蝨科之粉虱 (*Nisia nervosa*) 等、長翅飛蝨科之 *Kamendaka saccharivora* 等、稻蝨科之 *Achilus flammeus* 等、廣翅蠟蟬科之 *Orosanga japonicus* 等、蛾蠟蟬科之蛾蠟蟬 *Mimophantia maritima* 等、木蝨科之梨木蝨 (*Cacopsylla pyrisuga*) 等、麗木蝨科之椶果麗木蝨 (*Calophya mangiferae*) 等、Phylloxerae 之根瘤蚜 (*Daktulosphaira vitifoliae*) 等、球蚜科之日本落葉松球蚜 (*Adelges laricis*)、鐵杉球蚜 (*Adelges tsugae*) 等、常蚜科之豌豆蚜 (*Acyrtosiphon pisum*)、棉蚜 (*Aphis gossypii*)、捲葉蚜 (*Aphis spiraecola*)、偽菜蚜 (*Lipaphis erysimi*)、桃蚜 (*Myzus persicae*)、綠蚜 (*Schizaphis graminum*)、稻麥蚜 (*Rhopalosiphum padi*) 等、粉蝨科之柑橘刺粉蝨 (*Aleurocanthus spiniferus*)、煙草粉蝨 (*Bemisia tabaci*)、銀葉粉蝨 (*Bemisia argentifolii*)、溫室粉蝨 (*Trialeurodes vaporariorum*) 等、碩介殼蟲科之草履碩蚧 (*Drosicha corpulenta*)、吹綿介殼蟲 (*Icerya*

purchasi)等、粉介殼蟲科之鳳梨嫡粉介殼蟲(*Dysmicoccus brevipes*)、桔臀紋粉介殼蟲(*Planococcus citri*)、康氏粉介殼蟲(*Pseudococcus comstocki*)等、軟介殼蟲科之角蠟介殼蟲(*Ceroplastes ceriferus*)等、仁介殼蟲科之甘蔗仁介殼蟲(*Aclerda takahashii*)等、盾介殼蟲科之橘紅腎圓盾介殼蟲(*Aonidiella aurantii*)、梨齒盾介殼蟲(*Diaspidiotus perniciosus*)、箭頭介殼蟲(*Unaspis yanonensis*)等、盲蝽科之 *Lygus hesperus*、*Trigonotylus caelestialium* 等、網蝽科之杜鵑軍配蟲(*Stephanitis pyrioides*)、梨花網蝽(*Stephanitis nashi*)等、大紅蝽科之 *Eysarcoris aeneus*、*Lagynotomus elongatus*、稻綠椿(*Nezara viridula*)、珀椿(*Plautia crossota*)等、龜椿科之篩豆龜椿(*Megacopta cribraria*)等、長蝽科之小翅椿象(*Cavelerius saccharivorus*)等、家蠅科之 *Malcus japonicus* 等、紅蝽科之赤星椿象(*Dysdercus cingulatus*)等、蛛緣蝽科之禾蛛緣椿象(*Leptocorisa acuta*)、中華稻緣椿(*Leptocorisa chinensis*)等、緣蝽科之 *Anacanthocoris striicornis* 等、姬緣蝽科之 *Rhopalus maculatus* 等、臭蟲科之 *Cimex lectularis* 等。

鞘翅目害蟲，例如金龜子科之 *Anomara cuprea*、姬金龜(*Anomara rufocuprea*)、日本小金龜(*Popillia japonica*)、犀角金龜(*Oryctes rhinoceros*)等、叩頭蟲科之 *Agriotes ogurae*、*Melanotus okinawensis*、圓頸梳爪叩頭蟲(*Melanotus fortnumi fortnumi*)等、經節蟲科之小

圓皮蠹 (*Anthrenus verbasci*) 等、長蠹蟲科之 *Heterobostrychus hamatipennis* 等、標本甲科之 *Stegobium paniceum* 等、標本蟲科之 *Pitinus clavipes* 等、穀盜科之 *Tenebroides manritanicus* 等、郭公蟲科之赤足郭公蟲 (*Necrobia rufipes*)、出尾蟲科之 *Carpophilus hemipterus* 等、細扁甲科之背圓粉扁蟲 (*Ahasverus advena*) 等、姬扁甲科之角胸粉扁蟲 (*Cryptolestes ferrugineus*) 等、瓢蟲科之墨西哥豆瓢蟲 (*Epilachna varivestis*)、茄二十八星瓢蟲 (*Henosepilachna vigintioctopunctata*) 等、擬步行蟲科之黃粉蟲 (*Tenebrio molitor*)、赤擬穀盜 (*Tribolium castaneum*) 等、地膽科之 *Epicauta gorhami* 等、天牛科之光肩星天牛 (*Anoplophora glabripennis*)、葡萄虎天牛 (*Xylotrechus pyrrhoderus*)、松斑天牛 (*Monochamus alternatus*) 等、豆象科之綠豆象 (*Callosobruchus chinensis*) 等、金花蟲科之科羅拉多金花蟲 (*Leptinotarsa decemlineata*)、西方玉米根蟲 (*Diabrotica virgifera*)、猿葉蟲 (*Phaedon brassicae*)、黃條葉蚤 (*Phyllotreta striolata*) 等、三錐象鼻蟲科之甘藷蟻象 (*Cylas formicarius*) 等、象鼻蟲科之苜蓿象鼻蟲 (*Hypera postica*)、蔬菜象鼻蟲 (*Listroderes costirostris*)、甘藷象鼻蟲 (*Euscepes postfasciatus*) 等、*Erirhinidae* 之 *Echinocnemus bipunctatus*、水稻水象鼻蟲 (*Lissorhoptrus oryzophilus*) 等、步行象鼻蟲科之玉米象 (*Sitophilus zeamais*)、*Sphenophrus venatus* 等、

小蠹蟲科之松樹甲蟲(*Tomicus piniperda*)等、長小蠹蟲科之 *Crossotarsus niponicus* 等、粉蠹科之褐粉蠹(*Lyctus brunneus*)等。

雙翅目，例如大蚊科之 *Tipula aino* 等、毛蚋科之 *Plecia nearctica* 等、蕈蚋科之 *Exechia shiitakevora* 等、黑翅蕈蚋科之馬鈴薯蕈蚊(*Pnyxiascabiei*)等、癭蚋科之 *Asphondylia yushimai*、黑森癭蚊(*Mayetiola destructor*)等、蚊科之埃及斑蚊(*Aedes aegypti*)、淡色庫蚊(*Culex pipiens pallens*)等、蚋科之 *Simulium takahashii* 等、搖蚊科之稻搖蚊(*Chironomus oryzae*)等、蛇科之盲蛇(*Chrysops suavis*)、*Tabanus trigonus* 等、食蚜蠅科之灰條食蚜蠅(*Eumerus strigatus*)等、果實蠅科之東方果實蠅(*Bactrocera dorsalis*)、*Euphranta japonica*、地中海果實蠅(*Ceratitis capitata*)等、潛蠅科之非洲菊斑潛蠅(*Liriomyza trifolii*)、韭菜潛蠅(*Chromatomyia horticola*)等、稈蠅科之 *Meromyza nigriventris* 等、果蠅科之櫻桃果蠅(*Drosophila suzukii*)、黑腹果蠅(*Drosophila melanogaster*)等、水蠅科之水稻潛葉蠅(*Hydrellia griseola*)等、蝨蠅科之馬虱蠅(*Hippobosca equina*)等、糞蠅科之(*Parallelpmma sasakawae*)等、花蠅科之 *Delia antiqua*、種蠅(*Delia platura*)等、廁蠅科之黃腹廁蠅(*Fannia canicularis*)等、家蠅科之家蠅(*Musca domestica*)、廢螫蠅(*Stomoxys calcitrans*)等、肉蠅科之肉蠅(*Sarcophaga peregrina*)

等、馬蠅科之腸胃蠅(*Gasterophilus intestinalis*)等、皮蠅科之美國牛蠅(*Hypoderma lineatum*)等、Oestridae之羊狂蠅(*Oestrus ovis*)等。

鱗翅目，例如蝠蛾科之淡緣蝠蛾(*Endoclita excrescens*)等、豔小蛾科之 *Antispila ampelopsia* 等、蠹蛾科之六星黑點豹蠹蛾(*Zeuzera leuconotum*)等、捲蛾科之亂紋蘋果捲葉蛾(*Archips fuscocupreanus*)、茶姬捲葉蛾(*Adoxophyes orana fasciata*)、桃折心蟲(*Grapholita molesta*)、茶長捲蛾(*Homona magnanima*)、大豆食心蟲(*Leguminivora glycinivorella*)、蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*)等、Glyphipterigidae 之葡萄捲葉蛾(*Eupoecilia ambiguella*)等、蓑蛾科之 *Bambalina* sp.、茶避債蛾(*Eumeta minuscula*)等、蕈蛾科之歐洲谷蛾(*Nemapogon granella*)、衣蛾(*Tinea translucens*)等、稜巢蛾科之圓白菜飛蛾(*Bucculatrix pyrivorella*)等、潛蛾科之桃潛葉蛾(*Lyonetia clerkella*)等、細蛾科之茶細蛾(*Caloptilia theivora*)、*Phyllonorycter ringoniella* 等、Phyllocnistinae 之柑橘潛葉蛾(*Phyllocnistis citrella*)等、偽菜蛾科之 *Acrolepiopsis sapporensis* 等、巢蛾科之小菜蛾(*Plutella xylostella*)、*Yponomeuta orientalis* 等、銀蛾科之蘋實巢蛾(*Argyresthia conjugella*)等、透翅蛾科之 *Nokona regalis* 等、旋蛾科之馬鈴薯蠹蛾(*Phthorimaea operculella*)、麥蛾(*Sitotroga cerealella*)、棉紅鈴蟲(*Pectinophora*

gossypiella) 等、果蛀蛾科之桃蛀果蛾 (*Carposina sasakii*) 等、斑蛾科之梨星毛蟲 (*Illiberis pruni*) 等、刺蛾科之黃刺蛾 (*Monema flavescens*) 等、草螟科之稻巢草螟 (*Ancylolomia japonica*)、二化螟 (*Chilo suppressalis*)、稻縱捲葉野螟蛾 (*Cnaphalocrocis medinalis*)、亞洲玉米螟 (*Ostrinia furnacalis*)、玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*) 等、螟蛾科之粉斑螟蛾 (*Cadra cautella*)、蠟螟 (*Galleria mellonella*) 等、羽蛾科之小葡萄羽蛾 (*Nipoptilia vitis*) 等、鳳蝶科之柑橘鳳蝶 (*Papilio xuthus*) 等、粉蝶科之紋白蝶 (*Pieris rapae*) 等、弄蝶科之單帶弄蝶 (*Parnara guttata guttata*) 等、尺蛾科之腎斑尺蛾 (*Ascotis selenaria*) 等、枯葉蛾科之赤松芽蟲 (*Dendrolimus spectabilis*)、黃褐天幕毛蟲 (*Malacosoma neustrium testaceum*) 等、天蛾科之白薯天蛾 (*Agrius convolvuli*) 等、毒蛾科之茶毒蛾 (*Arna pseudoconspersa*)、舞毒蛾 (*Lymantria dispar*) 等、燈蛾科之美國白燈蛾 (*Hyphantria cunea*) 等、夜蛾科之球莖夜蛾 (*Agrotis ipsilon*)、*Autographa nigrisigna*、番茄夜蛾 (*Helicoverpa armigera*)、玉米穗蟲 (*Helicoverpa zea*)、綠棉夜蛾 (*Heliothis virescens*)、甜菜夜蛾 (*Spodoptera exigua*)、斜紋夜蛾 (*Spodoptera litura*) 等。

膜翅目，例如三節葉蜂科之薔薇葉蜂 (*Arge pagana*) 等、葉蜂科之 *Apethymus kuri*、黃翅菜葉蜂 (*Athalia rosae ruficornis*) 等、癭蜂科之板栗癭蜂 (*Dryocosmus*

kuriphilus)等、胡蜂科之 *Vespa simillima xanthoptera* 等、蟻科之入侵紅火蟻 (*Solenopsis invicta*) 等、切葉蜂科之竹盲椿 (*Megachile nipponica*) 等。

彈尾目害蟲，例如圓跳蟲科之 *Bourletiella hortensis* 等。

衣魚目害蟲，例如衣魚科之衣魚 (*Lepisma saccharina*)、衣魚 (*Ctenolepisma villosa*) 等。

蜚蠊目害蟲，例如蜚蠊科之美洲蟑螂 (*Periplaneta americana*)、昔蠊科之德國姬蠊 (*Blattella germanica*) 等。

白蟻目害蟲，例如木白蟻科之小楹白蟻 (*Incisitermes minor*) 等、鼻白蟻科之家白蟻 (*Coptotermes formosanus*) 等、白蟻科之黑翅土白蟻 (*Odontotermes formosanus*) 等。

啮蟲目害蟲，例如皮金龜科之粉茶蛀蟲 (*Trogium pulsatorium*) 等、書蝨科之書蝨 (*Liposcelis corrodens*) 等。

葉虱目害蟲，例如三葉葉虱科之雞長葉葉虱等、羽蝨科之 *Damalinea bovis* 等。

虱目害蟲，例如獸蝨科之豬血虱 (*Haematopinus suis*) 等、人蝨科之體蝨 (*Pediculus humanus*) 等、毛蝨科之犬虱 (*Linognathus setosus*) 等、毛虱科之毛虱等。

植物寄生性蟎類，例如走蟬科之 *Penthaleus major* 等、細蟎科之 *Phytonemus pallidus*、茶細蟎 (*Polyphagotarsonemus latus*) 等、蒲蟎科之蒲蟎之一種

(*Siteroptes* sp.) 等、姬葉蟎科之路易士偽葉蟎 (*Brevipalpus lewisi*) 等、杜克葉蟎科之孔雀杜克葉蟎 (*Tuckerella pavoniformis*) 等、葉蟎科之 *Eotetranychus boreus*、柑桔葉蟎 (*Panonychus citri*)、蘋果葉蟎 (*Panonychus ulmi*)、二點葉蟎 (*Tetranychus urticae*)、澤氏葉蟎 (*Tetranychus kanzawai*) 等、Nalepellidae 科之 *Trisetacus pini* 等、節蟬科之 *Aculops pelekassi*、梨銹蟬 (*Epitrimerus pyri*)、柑桔銹蟬 (*Phyllocoptruta oleivora*) 等、雙羽爪節蟬科之 *Diptacus crenatae* 等、粉蟎科之橢圓斑白蟎 (*Aleuroglyphus ovatus*)、腐食酪蟎 (*Tyrophagus putrescentiae*)、羅賓根蟎 (*Rhizoglyphus robini*) 等。

植物寄生性線蟲類，例如 Longidoridae 之劍線蟲 (*Xiphinema index*) 等、Trichodoridae 之 *Paratrachodor* minor 等、小桿科之一種 *Rhabditella* sp. 等、Tylenchidae 之一種 *Aglenchus* sp. 等、Tylodoridae 之一種 *Cephalenchus* sp. 等、Anguinidae 之 *Nothotylenchus acris*、馬鈴薯腐敗線蟲 (*Ditylenchus destructor*) 等、戈矛線蟲科之腎形線蟲 (*Rotylenchulus reniformis*)、螺旋線蟲 (*Helicotylenchus dihystra*) 等、Paratylenchidae 之 *Paratylenchus curvatus* 等、根瘤線蟲科之南方根瘤線蟲 (*Meloidogyne incognita*)、北方根瘤線蟲 (*Meloidogyne hapla*) 等、Heteroderidae 之黃金線蟲 (*Globodera rostochiensis*)、大豆胞囊線蟲 (*Heterodera*

glycines) 等、Telotylenchidae 之菸草矮化線蟲 (Tylenchorhynchus claytoni) 等、Psilenchidae 之螺旋線蟲之一種 Psilenchus sp. 等、環紋線蟲科之 Criconematidae 類之一種 Criconemoides sp. 等、Tylenchulidae 之柑桔線蟲 (Tylenchulus semipenetrans) 等、Sphaeronema 科之山茶根瘤線蟲 (Sphaeronema camelliae) 等、根腐線蟲科之 Sphaeronema camelliae、穿孔線蟲 (Radopholus citrophilus)、穿孔線蟲 (Radopholus similis)、假根瘤線蟲 (Nacobbus aberrans)、北方根腐線蟲 (Pratylenchus penetrans)、南方根腐線蟲 (Pratylenchus coffeae) 等、Iotonchium 科之 Iotonchium unguatum 等、Aphelenchus 科之 Aphelenchus avenae 等、Aphelenchoididae 之葉芽線蟲 (Aphelenchoides besseyi)、葉芽線蟲 (Aphelenchoides fragariae) 等、Bursaphelenchus 科之松材線蟲 (Bursaphelenchus xylophilus) 等。

植物寄生性軟體動物，例如羊角螺科之福壽螺 (Pomacea canaliculata) 等、黏液蛞蝓科之皺足蛞蝓 (Leavicaulis alte) 等、非洲大蝸牛科之非洲大蝸牛 (Achatina fulica) 等、黏液蛞蝓科之雙線蛞蝓 (Meghimatium bilineatum) 等、錐實蝸牛科之 Succinea lauta 等、Discidae 之 Discus pauper 等、琥珀蝸牛科之 Zonitoides yessoensis 等、蛞蝓科之黃蛞蝓 (Limax flavus)、網紋野蛞蝓 (Deroceras reticulatum) 等、鰲甲

蝸牛科之 *Parakaliella harimensis* 等、扁蝸牛科之 *Acusta despecta sieboldiana*、扁蝸牛 (*Bradybaena similaris*) 等。

其他有害動物、不快動物、衛生害蟲、家畜害蟲、寄生蟲等有害生物，例如：蟎目之巨刺蟎科之 *Ornithonyssus sylvialum* 等、瓦蟎科之蜜蜂蟹蟎 (*Varroa jacobsoni*) 等、皮刺蟎科之雞虱 (*Dermanyssus gallinae*) 等、巨刺蟎科之 (*Ornithonyssus sylvialum* 等、硬蜱科之微小牛蜱 (*Boophilus microplus*)、*Rhipicephalus sanguineus*、長角血蜱 (*Haemaphysalis longicornis*) 等、疥蟎科之人疥癬蟲 (*Sarcoptes scabiei*) 等、等脚目球鼠婦科之球鼠婦 (*Armadillidium vulgare*) 等、蝦目蜊蛄科之克氏原蜊蛄 (*Procambarus clarkii*) 等、毛潮蟲目毛潮蟲科之平甲蟲 (*Armadillidium vulgare*) 等、蛭目蛭科之蛭科或蛭目少棘蜈蚣 (*Scolopendra subspinipes*) 等蜈蚣害蟲目、條馬陸目奇馬陸科之高雅酸帶馬陸 (*Oxidus gracilis*) 等馬陸綱害蟲、蛛形目姬蛛科之 *Theridiidae hasseltii* 等、蛛形目袋蛛科之日本紅螯蛛 (*Chiracanthium japonicum*) 等、蠍目之 *Androctonus crassicauda* 等、線形動物內部寄生蟲迴蟲類 (*Ascaris lumbricoides*) 等、蟯蟲類 (*Syphacia* sp.) 等、心絲蟲類 (*Wuchereria bancrofti*) 等、扁形動物內部寄生蟲肝臟雙盤吸蟲 (*Distomum* sp.)、衛氏肺吸蟲 (*Paragonimus westermanii*)、橫川吸蟲 (*Metagonimus yokokawai*)、日本住血吸蟲 (*Schistosoma*

japonicum)、有鉤條蟲(Taenia solium)、無鉤條蟲(Taeniarhynchus saginatus)、棘球條蟲(Echinococcus sp.)、廣節裂頭條蟲(Diphyllobothrium latum)等。

本發明之有害生物防除劑，對於上述有害生物顯示優良的防除效果。又，本發明之有害生物防除劑，對於已對既存有害生物防除劑獲得抗藥性之前述例示的有害生物等也顯示防除效果。又，本發明之有害生物防除劑，也可使用在以基因重組、人工交配等而獲得害蟲耐性、病害耐性、除草劑耐性等特性的植物。

其次，以下列實施例詳細說明本發明化合物之製造方法、製劑方法及用途，但本發明不限定於此等實施例。

又，本發明化合物之製造中間體之製造法也一併記載。

【實施例】

[實施例 1]

1-(2-氟基-1,2-二異丙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 I-50)之製造

(1)於 2-氟基-2-異丙氧基亞胺基乙酸乙酯 1.0g(5.43 毫莫耳)之二氯甲烷溶液(5ml)中加入 0-異丙基羥基胺鹽酸鹽 0.73g(6.54 毫莫耳)，冷卻至 -20°C ，加入三甲基鋁己烷溶液(1.4mol/L)4.34ml(6.08 毫莫耳)後，升溫至室溫，並攪拌 20 小時。將反應混合物冷卻至 -20°C ，追加三甲基鋁己烷溶液 3.88ml(5.43 毫莫耳)，於室溫攪拌 6 小時。將反應混合物於冰冷下加水後以乙酸乙酯萃取，將有機層以飽和氯化鈉水溶液洗滌，並以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減

壓下餾去，將殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯：己烷 = 1:1)精製，獲得 2-氟基-2-異丙氧基亞胺基-N-異丙氧基乙醯胺 1.12g(產率 97%)。

又，2-氟基-2-異丙氧基亞胺基乙酸乙酯，係依據 Journal of Medicinal Chemistry 第 4608 頁~第 4612 頁(1992 年)記載之方法製造。

¹H-NMR 數據 (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 1.29(6H, d), 1.40(6H, d), 4.24(1H, qq), 4.69(1H, qq), 8.74(1H, s)

(2)於前述(1)獲得之 2-氟基-2-異丙氧基亞胺基-N-異丙氧基乙醯胺 0.40g(1.88 毫莫耳)之乙腈溶液(5ml)中，加入三苯基膦 1.48g(5.64 毫莫耳)及四氯化碳 1.73g(11.25 毫莫耳)，於加熱回流下攪拌 4 小時。將反應混合物冷卻至室溫後以乙酸乙酯萃取，以飽和氯化鈉水溶液洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯：己烷 = 1:2)精製，獲得 1-氯-2-氟基-1,2-二異丙氧基亞胺基乙烷 0.21g(產率 49%)。

¹H-NMR 數據 (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 1.37(6H, d), 1.39(6H, d), 4.62(1H, qq), 4.70(1H, qq)

(3)於前述(2)獲得之 1-氯-2-氟基-1,2-二異丙氧基亞胺基乙烷 0.21g(0.906 毫莫耳)之 N,N-二甲基甲醯胺溶液(5ml)中，加入 1,2,4-三唑 0.10g(1.45 毫莫耳)及碳酸鉀 0.13g(0.941 毫莫耳)，於 90℃ 攪拌 2 小時。將反應混合物冷卻至室溫後，以乙酸乙酯萃取，以飽和食鹽水洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱

層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷=1:1)精製,獲得標題化合物 0.22g(產率 92%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.33(6H, d), 1.35(6H, d), 4.54-4.71(2H, m), 8.08(1H, s), 8.66(1H, s)

[實施例 2]

1-[1,2-二異丙氧基亞胺基-2-(1H-四唑-5-基)乙基]-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 I-213)之製造

於 1-(2-氰基-1,2-二異丙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑 0.40g(1.51 毫莫耳)之甲苯溶液(5ml)中,加入三甲基矽基疊氮化物 0.35g(3.03 毫莫耳)及二正丁基錫氧化物 0.38g(1.51 毫莫耳),於加熱回流下攪拌 3 小時。將反應混合物冷卻至室溫後,以乙酸乙酯萃取,以飽和食鹽水洗滌,以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去,殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷=1:0)精製,將獲得之結晶以異丙醚洗滌,獲得標題化合物 0.23g(產率 47%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.43(6H, d), 1.49(6H, d), 4.66(1H, qq), 4.84(1H, qq), 7.85(1H, s), 9.34(1H, s), 13.59(1H, s)

[實施例 3]

1-(2-胺甲醯基-1,2-二異丙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 I-73)之製造

對於 1-(2-氰基-1,2-二異丙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑 4.0g(15.1 毫莫耳)之二甲基亞碲溶液

(2ml)，於冰冷下加入過氧化氫水 3.5ml 及碳酸鉀 2.30g(16.6 毫莫耳)，於室溫攪拌 10 小時。將析出之結晶依據以水、異丙醚洗滌，獲得標題化合物 3.28g(產率 77%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.38(12H, d), 4.53-4.70(2H, m), 6.35(1H, s), 7.39(1H, s), 7.95(1H, s), 9.20(1H, s)

[實施例 4]

1-[2-(4,5-二氫-1,3-噻唑啉-2-基)-1,2-二異丙氧基亞胺基乙基]-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 I-214)及 1-[1,2-二異丙氧基亞胺基-2-(噻唑-2-基)乙基]-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 I-215)之製造

(1) 於 1-(2-氰基-1,2-二異丙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑 0.70g(2.65 毫莫耳)與乙酸鉍 0.22g(2.91 毫莫耳)之甲醇溶液(5ml)，加入 2-胺基乙烷硫醇 0.22g(2.91 毫莫耳)，於室溫攪拌 16 小時。將反應混合物浸入水中，以乙酸乙酯萃取，以飽和食鹽水洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷 = 2:1)精製，獲得 1-[2-(4,5-二氫-1,3-噻唑啉-2-基)-1,2-二異丙氧基亞胺基乙基]-1H-1,2,4-三唑 0.47g(產率 55%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.37(6H, d), 1.39(6H, d), 3.18(2H, t), 4.05(2H, t), 4.52-4.68(2H, m), 7.92(1H, s), 9.18(1H, s)

(2) 於前述(1)獲得之 1-[2-(4,5-二氫-1,3-噻唑啉-2-

基)-1,2-二異丙氧基亞胺基乙基]-1H-1,2,4-三唑
 0.27g(0.832毫莫耳)之甲苯溶液(5ml)中，加入水 5ml、四
 正丁基銨溴 0.01g(0.031毫莫耳)及過錳酸鉀 0.39g(2.47
 毫莫耳)，於室溫攪拌 2 日。於反應混合物中加入過量之硫
 代硫酸鈉，攪拌 30 分鐘後，除去固體物後以乙酸乙酯萃
 取。將有機層以飽和食鹽水洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將
 溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸
 乙酯:己烷=1:1)精製，獲得標題化合物 0.15g(產率 56%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.41(6H, d),
 1.49(6H, d), 4.64(1H, qq), 4.79(1H, qq), 7.54(1H, d),
 7.82(1H, d), 7.84(1H, s), 9.36(1H, s)

[實施例 5]

1-[2-異丁氧基亞胺基-1-異丙氧基亞胺基-2-(1,2,4-
 噁二唑-2-基)乙基]-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號
 I-209)之製造

(1)於依據前述實施例 1 製造之 1-[2-氰基-2-異丁氧
 基亞胺基-1-異丙氧基亞胺基乙基]-1H-1,2,4-三唑
 1.68g(6.04毫莫耳)之乙醇溶液(10ml)中，加入羥基胺鹽
 酸鹽 0.46g(6.62毫莫耳)及乙酸鈉 0.54g(6.58毫莫耳)，
 於 50℃ 攪拌 3 小時。將反應混合物之溶劑於減壓下餾去，
 將析出之結晶以水與異丙醚洗滌，獲得 1-[2-(N-羥基甲脒
 基)-2-異丁基氧亞胺基-1-異丙氧基亞胺基乙
 基]-1H-1,2,4-三唑 0.91g(產率 48%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0.99(6H, d),

1.37(6H, d) , 2.01-2.17(1H, m) , 4.11(2H, d) ,
4.60(1H, qq) , 5.60(2H, s) , 7.48(1H, s) , 7.93(1H, s) ,
9.13(1H, s)

(2)於前述(1)獲得之 1-[2-(N-羥基甲脒基)-2-異丁基
氧亞胺基-1-異丙氧基亞胺基乙基]-1H-1,2,4-三唑
0.35g(1.12 毫莫耳)之正甲酸三乙酯溶液(5ml)中,加入對
甲苯磺酸一水合物 0.02g(0.11 毫莫耳),於 150°C 攪拌 3
小時。將反應混合物冷卻至室溫後,浸入水中,以乙酸乙
酯萃取,以飽和食鹽水洗滌,以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑
於減壓下餾去,殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:
己烷=1:2)精製,獲得標題化合物 0.23g(產率 64%)。

¹H-NMR 數據(CDCl₃/TMS δ(ppm)):0.98(6H, d) ,
1.37(6H, d) , 2.04-2.18(1H, m) , 4.21(2H, d) ,
4.61(1H, qq) , 7.89(1H, s) , 8.71(1H, s) , 9.12(1H, s)

[實施例 6]

1,2-二異丙氧基亞胺基-1,2-雙(1H-1,2,4-三唑-1-基)
乙烷(本發明化合物編號 I-212)之製造

(1)於 0-異丙基羥基胺鹽酸鹽 8.79g(78.78 毫莫耳)之
四氫呋喃溶液(40ml)中,於冰冷下加入碳酸鉀
21.78g(157.59 毫莫耳)及草醯氯 5.00g(39.39 毫莫耳),
於室溫攪拌 15 小時。將反應混合物浸入水中,以乙酸乙酯
萃取,以飽和食鹽水洗滌,以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於
減壓下餾去,獲得 N,N'-二異丙氧基草醯胺 3.39g(產率
42%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.29(12H, d), 4.22(2H, qq), 9.59(2H, s)

(2) 於前述(1)獲得之 $\text{N,N}'$ -二異丙氧基草醯胺 1.0g(4.9 毫莫耳)之二氯甲烷溶液(5ml)中，於冰冷下加入五氯化磷 2.04g(9.79 毫莫耳)，於室溫攪拌 4 小時。將反應混合物注入冰水中，以異丙醚萃取，並以飽和食鹽水洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷 = 1:4)精製，獲得 1,2-二氯-1,2-二異丙氧基亞胺基乙烷 0.19g(產率 16%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.35(12H, d), 4.59(2H, qq)

(3) 於前述(2)獲得之 1,2-二氯-1,2-二異丙氧基亞胺基乙烷 0.19g(0.788 毫莫耳)之 N,N -二甲基甲醯胺溶液(5ml)中，加入 1,2,4-三唑 0.16g(2.36 毫莫耳)及碳酸鉀 0.33g(2.36 毫莫耳)，於 100°C 攪拌 14 小時。將反應混合物冷卻至室溫，浸入水中，以乙酸乙酯萃取，以飽和食鹽水洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷 = 1:1)精製，獲得標題化合物 0.20g(產率 83%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.43(12H, d), 4.68(2H, qq), 7.81(2H, s), 9.25(2H, s)

[實施例 7]

1-(2-甲硫基-1,2-二異丙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 I-228)之製造

於前述實施例 6 製造之 1,2-二異丙氧基亞胺基-1,2-雙(1H-1,2,4-三唑-1-基)乙烷 0.35g(1.14 毫莫耳)之經加熱回流之四氫呋喃溶液(5ml)中，將硫代甲醇鈉以薄層層析一面確認反應一面加入，並攪拌 5 小時。將反應混合物冷卻至室溫，浸入水中，以乙酸乙酯萃取，以飽和食鹽水洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷=1:2)精製，獲得標題化合物 0.17g(產率 52%)。

¹H-NMR 數據 (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 1.31(6H, d), 1.39(6H, d), 2.14(3H, s), 4.50(1H, qq), 4.63(1H, qq), 8.05(1H, s), 9.23(1H, s)

[實施例 8]

1-(2-氯-1,2-二異丙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 I-4)之製造

(1)於 2-羥基亞胺基-2-1H-1,2,4-三唑-1-基乙酸乙酯 14g(76 毫莫耳)之 N,N-二甲基甲醯胺溶液(100ml)中，加入碘異丙烷 14g(82 毫莫耳)與碳酸鉀 13g(94 毫莫耳)，於室溫攪拌 5 小時。反應混合物浸入水中，以乙酸乙酯萃取，以無水硫酸鎂乾燥，於減壓下濃縮。將得到的殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷=1:8)精製，獲得 2-異丙氧基亞胺基-2-1H-1,2,4-三唑-1-基乙酸乙酯 9.0g(產率 52%)。

又，2-羥基亞胺基-2-1H-1,2,4-三唑-1-基乙酸乙酯，係依據 Journal of the Chemical Society Perkin

Transactions 1 第 2235 頁~第 2239 頁(1987 年)記載之方法製造。

$^1\text{H-NMR}$ 數據(CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.36(6H, d), 1.37(3H, t), 4.43(2H, q), 4.63(1H, sep), 8.06(1H, s), 8.79(1H, s)

(2)於前述(1)獲得之 2-異丙氧基亞胺基-2-1H-1,2,4-三唑-1-基乙酸乙酯 13g(57 毫莫耳)之 1,4-二噁烷溶液(60ml)中,加入溶於水(15ml)之氫氧化鋰 1 水合物 2.9g(69 毫莫耳)溶液,於室溫攪拌 12 小時。於反應混合物中加入己烷與碳酸氫鈉飽和水溶液並分液,將水層以稀鹽酸調成酸性後,以乙酸乙酯萃取,將有機層以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去,獲得 2-異丙氧基亞胺基-2-1H-1,2,4-三唑-1-基乙酸 9.7g(產率 86%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據(CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.40(6H, d), 4.74(1H, sep), 8.18(1H, s), 8.99(1H, s)

(3)於前述(2)獲得之 2-異丙氧基亞胺基-2-1H-1,2,4-三唑-1-基乙酸 5.5g(28 毫莫耳)之二氯甲烷溶液(50ml),加入 0-異丙基羥基胺鹽酸鹽 3.9g(33 毫莫耳)、N-甲基嗎啉 3.4g(34 毫莫耳)及 N-(3-二甲基氨基丙基)-N'-乙基碳二醯亞胺鹽酸鹽(WSC)8.0g(42 毫莫耳),於室溫攪拌 12 小時。將反應混合物浸入稀鹽酸,以二氯甲烷萃取,以無水硫酸鎂乾燥,將溶劑於減壓下餾去。將獲得之結晶以二異丙醚洗滌,獲得 N-異丙氧基-2-異丙氧基亞胺基-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)乙醯胺 3.9g(產率 55%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.28-1.40(12H, m), 1.37(3H, t), 4.29(1H, sep), 4.58(1H, sep), 8.08(1H, s), 8.82(1H, s), 9.66(1H, s)

(4)於前述(3)獲得之 N-異丙氧基-2-異丙氧基亞胺基-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)乙醯胺 0.74g(2.9 毫莫耳)之乙腈溶液(20ml), 加入三苯基膦 2.3g(8.8 毫莫耳)與四氯化碳 2.7g(18 毫莫耳), 於加熱回流下攪拌 12 小時。將反應混合物於減壓下餾去, 獲得之殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷=1:8)精製, 得到標題化合物 0.47g(產率 59%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.31(6H, s), 1.35(6H, d), 4.51(1H, sep), 4.61(1H, sep), 8.06(1H, s), 8.77(1H, s)

[實施例 9]

1-(1,2-二異丙氧基亞胺基-2-甲氧基乙基)-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 I-165)之製造

於前述實施例 8 製造之 N-異丙氧基-2-異丙氧基亞胺基-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)乙醯胺 0.4g(1.57 毫莫耳)與碳酸鉀 0.22g(1.59 毫莫耳)之 N,N-二甲基甲醯胺溶液(5ml)中, 於冰冷下加入碘甲烷 0.22g(1.55 毫莫耳), 再於室溫攪拌 20 小時。將反應混合物浸入水中, 以乙酸乙酯萃取, 並以飽和氯化鈉水溶液洗滌, 以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去, 殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷=1:2)精製, 獲得標題化合物 0.12g(產率 29%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0.97(6H, d), 1.38(6H, d), 2.01-2.16(1H, m), 2.05(3H, s), 4.00(2H, d), 4.61(1H, qq), 7.93(1H, s), 8.24(1H, s), 9.22(1H, s).

[實施例 10]

1-(2-異丙氧基亞胺基-2-硫胺甲醯基-1-甲氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 II-224)之製造

於 1-(2-胺甲醯基-2-異丙氧基亞胺基-1-甲氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑 0.40g(1.6 毫莫耳)之四氫呋喃(8ml)溶液中，於室溫加入勞森試藥 0.77g(1.9 毫莫耳)，於 40℃ 攪拌 2 小時，再於 60℃ 攪拌 3 小時。反應混合物冷卻至室溫後，加入二異丙醚，以水及飽和食鹽水洗滌，以無水硫酸鈉乾燥，將溶劑餾去。得到的殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷 = 1:2)精製，獲得標題化合物 0.25g(產率 58%)黃色粉末。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.24(6H, d), 4.15(3H, s), 4.52(1H, sep), 7.72(1H, s), 7.94(1H, s), 8.10(1H, s), 9.24(1H, s)

[實施例 11]

2-異丙氧基亞胺基-3-甲氧基亞胺基-3-1H-1,2,4-三唑-1-基丙烷羧醯胺酸甲酯(本發明化合物編號 II-223)之製造

於 1-(2-氰基-2-異丙氧基亞胺基-1-甲氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑 5.0g(21 毫莫耳)之甲醇(50ml)溶液

中，於冰冷下滴加甲醇鈉 28% 甲醇溶液 1.6g (8.4 毫莫耳)，再於冰冷下攪拌 2 小時。於反應混合液中加入少量之檸檬酸水溶液，以乙酸乙酯萃取，並以飽和重碳酸鈉水溶液及食鹽水洗滌，以無水硫酸鈉乾燥。將溶劑餾去，獲得之殘渣以矽膠管柱層析（洗提溶劑 乙酸乙酯：己烷 = 1:2）精製，獲得標題化合物 2.5g (產率 44%) 黃色油狀物質。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.36 (6H, d), 3.61 (3H, s), 4.14 (3H, s), 4.60 (1H, sep), 7.97 (1H, s), 8.92 (1H, s), 9.08 (1H, s)

[實施例 12]

1-(2-異丙氧基亞胺基-2-甲氧基羰基-1-甲氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑 (本發明化合物編號 II-221) 之製造

於前述實施例 11 製造之 2-異丙氧基亞胺基-3-甲氧基亞胺基-3-1H-1,2,4-三唑-1-基丙烷羧醯胺酸甲酯 2.5g (9.3 毫莫耳) 之甲醇 (20ml) 溶液中，於冰冷下加入 3mol/l 鹽酸 (12ml)，並攪拌 40 分鐘。於反應混合物中加水，以乙酸乙酯萃取，以飽和重碳酸鈉水溶液及食鹽水洗滌，以無水硫酸鈉乾燥。將溶劑餾去，獲得標題化合物 2.4g (產率 95%) 無色油狀物質。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.26 (6H, d), 3.86 (3H, s), 4.10 (3H, s), 4.46 (1H, sep), 8.05 (1H, s), 8.67 (1H, s)

[實施例 13]

1-(2-異丙氧基亞胺基-2-N,N-二甲基胺甲鹽基-1-甲氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 II-226)之製造

於二甲基胺鹽酸鹽 0.36g(4.4 毫莫耳)之 1,2-二氯乙烷(7ml)懸浮液中，於室溫下滴加三甲基鋁 1mol/l 己烷溶液 4.4ml(4.4 毫莫耳)，再於 80°C 攪拌 30 分鐘。於該反應混合物中於 60°C 加入前述實施例 12 製造之 1-(2-異丙氧基亞胺基-2-甲氧基羰基-1-甲氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑 0.30g(1.1 毫莫耳)之 1,2-二氯乙烷(3ml)溶液，再攪拌 1.5 小時。將反應混合物冷卻至室溫後，以異丙醚稀釋，並加入少量水並攪拌，過濾生成的沉澱物。將溶劑餾去，獲得之殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷=2:1)精製，獲得標題化合物 0.30g(產率 97%)黃色油狀物質。

¹H-NMR 數據 (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 1.23(6H, d), 3.02(3H, s), 3.05(3H, s), 4.07(3H, s), 4.42(1H, sep), 8.06(1H, s), 8.57(1H, s)

[實施例 14]

2-異丙氧基亞胺基-3-甲氧基亞胺基-3-1H-1,2,4-三唑-1-基丙烷硫酸甲基 S-乙酯(本發明化合物編號 II-222)之製造

於 1,2-二氯乙烷(8ml)加入三甲基鋁 1mol/l 己烷溶液 7.5ml(7.5 毫莫耳)，於該混合溶液中於室溫滴加乙烷硫醇 0.47g(7.5 毫莫耳)，並攪拌 30 分鐘。於該混合溶液中

於室溫加入前述實施例 12 製造之 1-(2-異丙氧基亞胺基-2-甲氧基羰基-1-甲氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑 0.50g(1.9 毫莫耳)之 1,2-二氯乙烷溶液，攪拌 1.5 小時。反應混合物以異丙醚稀釋，加入少量之水並攪拌，過濾生成的沉澱物。將溶劑餾去，獲得之殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷 = 1:2)精製，獲得標題化合物 0.56g(產率 98%)黃色油狀物質。

¹H-NMR 數據 (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 1.34(6H, d), 2.99(2H, q), 4.12(3H, s), 4.54(1H, sep), 7.99(1H, s), 8.88(1H, s)

[實施例 15]

1-(2-胺基-1,2-二異丙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 I-119)之製造

(1)於前述實施例 8 之(1)製造之 2-異丙氧基亞胺基-2-1H-1,2,4-三唑-1-基乙酸乙酯 24.17g(106.84 毫莫耳)之甲醇溶液(40ml)，於冰冷下加入 30% 氨水溶液 12.13g(213.68 毫莫耳)並攪拌 3 小時。將反應混合物之溶劑減壓餾去，獲得之殘渣溶於二氯甲烷溶液(40ml)，於該溶液中，於冰冷下加入吡啶 16.90g(213.65 毫莫耳)、三氟乙酸酐 24.68g(117.51 毫莫耳)，並攪拌 4 小時。將反應混合物以乙酸乙酯萃取，以飽和氯化鈉水溶液洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷 = 2:1)精製，獲得 1-(1-氨基-1-異丙氧基亞胺基甲基)-1H-1,2,4-三唑 19.14g(產率

100%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.45(6H, d), 4.74(1H, qq), 8.10(1H, s), 9.14(1H, s)

(2)於前述(1)獲得之 1-(1-氟基-1-異丙氧基亞胺基甲基)-1H-1,2,4-三唑 0.4g(2.23 毫莫耳)之乙醇溶液(5ml)中，加入碳酸鉀 0.46g(3.33 毫莫耳)、0-異丙基羥基胺鹽酸鹽 0.37g(3.32 毫莫耳)，於加熱回流下攪拌 5 小時。反應混合物回到室溫後，以乙酸乙酯萃取，有機層以飽和氯化鈉水溶液洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷 = 1:2)精製，獲得標題化合物 0.09g(產率 16%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.19(6H, d), 1.29(6H, d), 4.22(1H, qq), 4.51(1H, qq), 4.92(2H, s), 8.07(1H, s), 8.38(1H, s).

[實施例 16]

1-(2-溴-1,2-二異丙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 I-142)之製造

於前述實施例 15 製造之 1-(2-胺基-1,2-二異丙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑 0.13g(0.51 毫莫耳)中，對於已加入水 5ml、47%氫溴酸 0.5ml 之溶液，於冰冷下加入由亞硝酸鈉 0.04g(0.58 毫莫耳)與水 3ml 構成的水溶液並攪拌。4 小時後，將反應混合物以乙酸乙酯萃取，有機層以飽和氯化鈉水溶液洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷

= 1:2)精製，獲得標題化合物 0.11g(產率 68%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.32(6H, d), 1.36(6H, d), 4.50-4.67(2H, m), 8.05(1H, s), 8.82(1H, s)

[實施例 17]

1-(2-胺基-2-異丁氧基亞胺基-1-異丙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 I-121)之製造

(1)於前述實施例 15 之(1)製造之 1-(1-氰基-1-異丙氧基亞胺基甲基)-1H-1,2,4-三唑 15.06g(84.05 毫莫耳)之甲醇溶液(120ml)中，加入碳酸鉀 13.94g(100.86 毫莫耳)及羥基胺鹽酸鹽 6.50g(93.54 毫莫耳)，於加熱回流下攪拌 2 小時。將反應混合物冷卻至室溫後，反應溶液以 2N-HCl 調成 pH4，以乙酸乙酯萃取。將有機層以飽和氯化鈉水溶液洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，獲得 1-(2-胺基-2-羥基亞胺基-1-異丙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑 14.81g(產率 83%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.30(6H, d), 4.54(1H, qq), 5.05(2H, s), 7.98(1H, s), 8.08(1H, s), 8.44(1H, s)

(2)於前述(1)獲得之 1-(2-胺基-2-羥基亞胺基-1-異丙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑 3.00g(14.14 毫莫耳)與溴化異丁烷 2.13g(15.55 毫莫耳)之 N,N-二甲基甲醯胺溶液(30ml)中，於冰冷下加入氫化鈉 0.59g(63.3 重量%、15.56 毫莫耳)，並於室溫攪拌 2 小時。將反應混合物浸入水中，以乙酸乙酯萃取，以飽和氯化鈉水溶液洗滌，以無

水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷 = 2:1)精製，獲得標題化合物 2.71g(產率 72%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0.89(6H, d), 1.29(6H, d), 1.88-1.99(1H, m), 3.77(2H, d), 4.52(1H, qq), 4.97(2H, s), 8.07(1H, s), 8.39(1H, s)

[實施例 18]

1-[2-N-乙醯基胺基-2-異丁基氧亞胺基-1-異丙氧基亞胺基乙基]-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 I-217)之製造

於前述實施例 17 製造之 1-(2-胺基-2-異丁氧基亞胺基-1-異丙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑 0.4g(1.49 毫莫耳)之甲苯溶液(5ml)中，加入乙醯氯 0.58g(7.39 毫莫耳)，於 100°C 攪拌 10 小時。反應混合物冷卻至室溫後，以乙酸乙酯萃取，以飽和氯化鈉水溶液洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷 = 2:1)精製，獲得標題化合物 0.34g(產率 74%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0.97(6H, d), 1.38(6H, d), 2.01-2.16(1H, m), 2.05(3H, s), 4.00(2H, d), 4.61(1H, qq), 7.93(1H, s), 8.24(1H, s), 9.22(1H, s)

[實施例 19]

1-[2-N-甲氧基羰基胺基-2-異丁基氧亞胺基-1-異丙氧基亞胺基乙基]-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號

I-219)之製造

於前述實施例 17 製造之 1-(2-胺基-2-異丁氧基亞胺基-1-異丙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑 0.34g(1.27 毫莫耳)之 N,N-二甲基乙醯胺溶液(5ml)中，於冰冷下加入 55%氫化鈉 0.06g(1.40 毫莫耳)，於室溫攪拌 5 分鐘。於該混合物中，於冰冷下加入氯甲酸甲酯 0.13g(1.40 毫莫耳)，於室溫攪拌 18 小時。將反應混合物以乙酸乙酯萃取，以氯化鈉水溶液洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷=1:2)精製，獲得二取代體(1-[2-N,N-二甲氧基羰基胺基-2-異丁基氧亞胺基-1-異丙氧基亞胺基乙基]-1H-1,2,4-三唑)。在二取代體之甲醇溶液(5ml)中加入碳酸鉀使成為約 pH9，於 70°C 攪拌 10 小時。將反應混合物冷卻至室溫後，以乙酸乙酯萃取，以飽和氯化鈉水溶液洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷=2:1)精製，獲得標題化合物 0.18g(產率 43%)。

¹H-NMR 數據(CDCl₃/TMS δ(ppm)):0.96(6H, d), 1.39(6H, d), 1.98-2.13(1H, m), 3.62(3H, s), 3.98(2H, d), 4.62(1H, qq), 7.79(1H, s), 7.95(1H, s), 9.24(1H, s)

[實施例 20]

1-(1,2-二異丙氧基亞胺基丙基)-2-巰基咪唑(本發明化合物編號 V-10)之製造

(1)於丙酮酸 3.00g(34.07 毫莫耳)之二氯甲烷溶液

(100ml)中，加入異丙基羥基胺鹽酸鹽 7.98g(71.52 毫莫耳)及 N-(3-二甲基胺基丙基)-N'-乙基碳二醯亞胺鹽酸鹽(WSC)13.71g(71.52 毫莫耳、)。之後，於冰冷下加入 N-甲基嗎啉 14.47g(143.05 毫莫耳)，於室溫攪拌 20 小時。將反應混合物浸入水中，以乙酸乙酯萃取，以飽和氯化鈉水溶液洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷=1:3)精製，獲得 2-異丙氧基亞胺基-N-異丙氧基丙酸醯胺 5.00g(產率 73%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.27(6H, d), 1.28(6H, d), 2.02(3H, s), 4.18(1H, qq), 4.40(1H, qq), 8.91(1H, s)

(2)於前述(1)獲得之 2-異丙氧基亞胺基-N-異丙氧基丙酸醯胺 3.00g(14.83 毫莫耳)之乙腈溶液(20ml)中，加入三苯基膦 7.78g(29.66 毫莫耳)及四氯化碳 9.13g(59.36 毫莫耳)，於加熱回流下攪拌 4 小時。反應混合物冷卻至室溫後，以乙酸乙酯萃取，以飽和氯化鈉水溶液洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷=1:2)精製，獲得 1-氯-1,2-二異丙氧基亞胺基丙烷 2.63g(產率 80%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.29(6H, d), 1.33(6H, d), 2.10(3H, s), 4.42-4.58(2H, m)

(3)於前述(2)獲得之 1-氯-1,2-二異丙氧基亞胺基丙烷 1.00g(4.53 毫莫耳)之 N,N-二甲基甲醯胺溶液(5ml)

中，加入咪唑 0.37g(5.43 毫莫耳)及碳酸鉀 0.75g(5.43 毫莫耳)，於 90℃ 攪拌 4 小時。將反應混合物冷卻至室溫後，浸入水中，以乙酸乙酯萃取，以飽和食鹽水洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷=1:2)精製，獲得 1-(1,2-二異丙氧基亞胺基丙基)咪唑(本發明化合物編號 I-273)0.83g(產率 73%)。

¹H-NMR 數據(CDC1₃/TMS δ(ppm)):1.21(6H, d), 1.28(6H, d), 2.15(3H, s), 4.32(1H, qq), 4.46(1H, qq), 7.05(1H, s), 7.18(1H, s), 7.77(1H, s)

(4)於前述(3)獲得之 1-(1,2-二異丙氧基亞胺基丙基)咪唑 0.40g(1.59 毫莫耳)之四氫呋喃溶液(5ml)中，於 -60℃ 加入正丁基鋰(1.57mol/L)1.01ml(1.59 毫莫耳)，並攪拌 30 分鐘，於該混合物中加入硫粉末 0.05g(1.59 毫莫耳)，於 -60℃ 攪拌 3 小時。將反應混合物冷卻至室溫後，加入 2N-鹽酸並攪拌一晚。將反應混合物以乙酸乙酯萃取，以飽和食鹽水洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，殘渣以矽膠管柱層析(洗提溶劑 乙酸乙酯:己烷=1:2)精製，將得到的結晶以己烷洗滌，藉此獲得標題化合物 0.14g(產率 31%)。

¹H-NMR 數據(CDC1₃/TMS δ(ppm)):1.18(6H, d), 1.28(6H, d), 2.17(3H, s), 4.27(1H, qq), 4.50(1H, qq), 6.57(1H, s), 6.71(1H, s), 11.02(1H, s)

[實施例 21]

1-(2-正丁氧基亞胺基-2-氰基-1-乙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 III-51)之製造

(1)將依照 Synthesis 第46頁~第48頁(1999年)記載之方法製造之2-氰基-2-羥基亞胺基乙酸甲基2.00g(15.6毫莫耳)、正丁基溴2.35g(17.2毫莫耳)、碳酸鉀2.59g(18.7毫莫耳)及DMF10ml構成的混合物於室溫攪拌8小時。將反應混合物浸入水中，以乙酸乙酯萃取，有機層以飽和氯化鈉水溶液洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，獲得2-正丁氧基亞胺基-2-氰基乙酸甲酯2.05g(產率71%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0.94(3H, t), 1.41(2H, q), 1.74-1.84(2H, m), 3.96(3H, s), 4.53(2H, t)

(2)於前述(1)獲得之2-正丁氧基亞胺基-2-氰基乙酸甲酯1.00g(5.43毫莫耳)之1,4-二噁烷溶液(20ml)中，加入氫氧化鋰1水合物0.25g(6.0毫莫耳)之水溶液(10ml)，於室溫攪拌3小時。於該反應混合物中加入己烷及碳酸氫鈉飽和水溶液並分液。將水層以稀鹽酸調成酸性後，以乙酸乙酯萃取，有機層以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，獲得2-正丁氧基亞胺基-2-氰基乙酸0.90g(產率98%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0.97(3H, t), 1.42(2H, q), 1.76-1.86(2H, m), 4.56(2H, t)

(3)於前述(2)獲得之2-正丁氧基亞胺基-2-氰基乙酸0.90g(5.3毫莫耳)之二氯甲烷溶液(20ml)中，加入0-乙基羥基胺鹽酸鹽0.57g(5.8毫莫耳)、N-甲基嗎啉0.59g(5.8

毫莫耳)及N-(3-二甲基胺基丙基)-N'-乙基碳二醯亞胺鹽酸鹽(WSC)1.5g(7.8毫莫耳)，於室溫攪拌12小時。將反應混合物浸入稀鹽酸，以二氯甲烷萃取，有機層以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，將獲得之殘渣以管柱層析(乙酸乙酯:己烷=1:4)精製，獲得N-乙氧基-2-正丁氧基亞胺基-2-氰基乙醯胺0.55g(產率49%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0.97(3H, t), 1.31(3H, t), 1.41(2H, q), 1.72-1.81(2H, m), 4.06(2H, q), 4.44(2H, t), 8.88(1H, s)

(4)於前述(3)獲得之N-乙氧基-2-正丁氧基亞胺基-2-氰基乙醯胺0.45g(2.1毫莫耳)之乙腈溶液(20ml)中，加入三苯基膦2.3g(8.8毫莫耳)及四氯化碳2.7g(18毫莫耳)，於加熱回流下攪拌3小時。將反應混合物於減壓下濃縮，獲得之殘渣以管柱層析(乙酸乙酯:己烷=1:9)精製，獲得2-正丁氧基亞胺基-1-氯-2-氰基-1-乙氧基亞胺基乙烷0.24g(產率48%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0.97(3H, t), 1.40(3H, t), 1.44(2H, q), 1.74-1.81(2H, m), 4.38-4.47(4H, m)

(5)將由前述(4)獲得之2-正丁氧基亞胺基-1-氯-2-氰基-1-乙氧基亞胺基乙烷1.30g(5.6毫莫耳)、1,2,4-三唑0.76g(11毫莫耳)、碳酸鉀1.50g(11毫莫耳)及DMF7ml構成的混合物於70°C攪拌2小時。將反應混合物冷卻至室溫後浸入水中，以乙酸乙酯萃取，將有機層以飽和氯化鈉水溶液

洗滌，以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去，獲得之殘渣以管柱層析(乙酸乙酯:己烷=1:9)精製，獲得標題化合物1.32g(產率89%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0.94(3H, t), 1.35-1.46(5H, m), 1.72(2H, m), 4.35-4.45(4H, m), 8.09(1H, s), 8.66(1H, s)

[實施例22]

1-(2-正丁氧基亞胺基-2-胺甲醯基-1-乙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 III-74)之製造

於前述實施例17製造之1-(2-正丁氧基亞胺基-2-氰基-1-乙氧基亞胺基乙基)-1H-1,2,4-三唑0.98g(3.7毫莫耳)之甲醇溶液(5ml)中，於室溫下加入四丁基溴化銨60mg(0.19毫莫耳)、碳酸鉀55mg(0.40毫莫耳)及30wt%過氧化氫水1.7g(15毫莫耳)，並攪拌10小時。於反應混合物加入二硫代硫酸鈉並攪拌10分鐘後，將反應混合物於減壓下濃縮。獲得之結晶依序以檸檬酸水溶液、冷水、異丙醚洗滌，獲得標題化合物0.64g(產率61%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 0.97(3H, t), 1.40-1.48(5H, m), 1.76(2H, m), 4.35-4.45(4H, m), 6.16(1H, s), 7.31(1H, s), 7.96(1H, s), 9.18(1H, s)

[實施例23]

1-[2-氰基-1,2-雙(正丙氧基亞胺基)乙基]-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 IV-90)之製造

(1)將由2-氰基-2-羥基亞胺基乙酸甲基2.50g(19.5毫

莫耳)、正丙基溴 2.60g(21.1毫莫耳)、碳酸鉀 3.20g(23.2毫莫耳)及 DMF 10ml 構成的混合物於室溫攪拌 8 小時。將反應混合物浸入水中,以乙酸乙酯萃取,將有機層以飽和氯化鈉水溶液洗滌,以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去,獲得 2-氰基-2-正丙氧基亞胺基乙酸甲酯 2.35g(產率 71%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.00(3H, t), 1.78-1.90(2H, m), 3.97(3H, s), 4.49(2H, t)

(2) 於前述(1)獲得之 2-氰基-2-正丙氧基亞胺基乙酸甲酯 1.50g(8.81毫莫耳)之 1,4-二噁烷溶液(20ml)中,加入氫氧化鋰 1 水合物 0.41g(9.8毫莫耳)之水溶液(10ml),於室溫攪拌 3 小時。於反應混合物中加入己烷與碳酸氫鈉飽和水溶液並分液。將水層以稀鹽酸調成酸性後,以乙酸乙酯萃取,有機層以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去,獲得 2-氰基-2-正丙氧基亞胺基乙酸 1.28g(產率 93%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 1.00(3H, t), 1.79-1.91(2H, m), 4.52(2H, t)

(3) 於前述(2)獲得之 2-氰基-2-正丙氧基亞胺基乙酸 1.28g(8.20毫莫耳)之二氯甲烷溶液(20ml)中,加入 0-正丙基羥基胺鹽酸鹽 1.00g(8.96毫莫耳)、N-甲基嗎啉 0.91g(9.0毫莫耳)及 N-(3-二甲基胺基丙基)-N'-乙基碳二醯亞胺鹽酸鹽(WSC) 2.5g(13毫莫耳),於室溫攪拌 12 小時。將反應混合物浸入稀鹽酸中,以二氯甲烷萃取,有機層以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去,獲得之殘渣以

管柱層析(乙酸乙酯:己烷=1:4)精製,獲得N-正丙氧基-2-氧基-2-正丙氧基亞胺基乙醯胺0.77g(產率44%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據(CDCl_3/TMS δ (ppm)):0.96-1.03(6H, m), 1.66-1.87(4H, m), 3.96(2H, t), 4.39(2H, t), 8.86(1H, s)

(4)於前述(3)獲得之N-正丙氧基-2-氧基-2-正丙氧基亞胺基乙醯胺0.59g(2.8毫莫耳)之乙腈溶液(20ml)中,加入三苯基膦2.2g(8.4毫莫耳)及四氯化碳2.6g(17毫莫耳),於加熱回流下攪拌3小時。將反應混合物於減壓下濃縮,獲得之殘渣以管柱層析(乙酸乙酯:己烷=1:9)精製,獲得1-氯-2-氧基-1,2-雙(正丙氧基亞胺基)乙烷 0.45g(產率69%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據(CDCl_3/TMS δ (ppm)):0.96-1.02(6H, m), 1.76-1.85(4H, m), 4.31(2H, t), 4.40(2H, t)

(5)將由前述(4)獲得之1-氯-2-氧基-1,2-雙(正丙氧基亞胺基)乙烷0.45g(1.9毫莫耳)、1,2,4-三唑0.20g(2.9毫莫耳)、碳酸鉀0.53g(3.8毫莫耳)及DMF10ml構成的混合物於40℃攪拌12小時。將反應混合物冷卻至室溫後浸入水中,以乙酸乙酯萃取,將有機層以飽和氯化鈉水溶液洗滌,以無水硫酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去,獲得標題化合物0.40g(產率80%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據(CDCl_3/TMS δ (ppm)):0.94-1.02(6H, m), 1.70-1.84(4H, m), 4.29-4.37(4H, m), 8.09(1H, s), 8.66(1H, s)

[實施例24]

1-[2-胺甲鹽基-1,2-雙(正丙氧基亞胺基)乙基]-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 IV-101)之製造

於前述實施例23製造之1-[2-氰基-1,2-雙(正丙氧基亞胺基)乙基]-1H-1,2,4-三唑1.06g(4.0毫莫耳)之甲醇溶液(5ml)中，於室溫加入四丁基溴化銨65mg(0.20毫莫耳)、碳酸鉀55mg(0.40毫莫耳)及30wt%過氧化氫水1.8g(16毫莫耳)並攪拌10小時。於反應混合物中加入二硫代硫酸鈉並攪拌10分鐘，將反應混合物於減壓下濃縮。獲得之結晶依據以檸檬酸水溶液、冷水、異丙醚洗滌，獲得標題化合物0.73g(產率64%)。

¹H-NMR 數據 (CDCl₃/TMS δ (ppm)): 1.00(6H, t), 1.77-1.84(4H, m), 4.31(2H, t), 4.35(2H, t), 6.13(1H, s), 7.34(1H, s), 7.96(1H, s), 9.18(1H, s)

[實施例 25]

1-[2-氰基-2-(2,2,3,3,3-五氟-正丙氧基亞胺基)-1-(2,2,2-三氟乙氧基亞胺基)乙基]-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 IV-185)之製造

(1)於依據前述實施例1製造之1-[2-苄氧基亞胺基-2-氰基-1-(2,2,2-三氟乙氧基亞胺基)乙基]-1H-1,2,4-三唑(本發明化合物編號 IV-181)1.70g(4.83毫莫耳)中，加入5wt% 鈰碳0.34g(0.16毫莫耳)，於氮氣氣流下加入乙醇10ml。於該混合液中，於室溫下、常壓加入1.5小時氮氣。濾去不溶物，於減壓下濃縮並將獲得之殘渣以管柱層析(乙酸乙酯:己烷 = 1:1)精製，獲得1-[2-氰基-2-羥基亞胺基

-1-(2,2,2-三氟乙氧基亞胺基)乙基]-1H-1,2,4-三唑
1.26g(產率100%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 5.04(2H, q),
8.36(1H, s), 9.00(1H, s)

(2) 將前述(1)獲得之1-[2-氟基-2-羥基亞胺基-1-(2,2,2-三氟乙氧基亞胺基)乙基]-1H-1,2,4-三唑
1.26g(4.81毫莫耳)溶於DMSO 10ml, 於該溶液中加入九氟-
正丁烷磺酸2,2,3,3,3-五氟-正丙酯2.49g(5.77毫莫耳)及
碳酸鉀0.80g(5.77毫莫耳), 於室溫下攪拌10小時。於該反
應混合物再加入九氟-正丁烷磺酸2,2,3,3,3-五氟-正丙酯
1.25g(2.89毫莫耳)及碳酸鉀0.40g(2.81毫莫耳), 於70°C
攪拌7小時。將反應混合物冷卻至室溫後浸入水中, 以乙酸
乙酯萃取, 將有機層以飽和氯化鈉水溶液洗滌, 以無水硫
酸鎂乾燥。將溶劑於減壓下餾去, 獲得之殘渣以管柱層析(
乙酸乙酯:己烷=1:1)精製, 獲得標題化合物0.50g(產率
26%)。

$^1\text{H-NMR}$ 數據 (CDCl_3/TMS δ (ppm)): 4.63-4.89(4H, m),
8.13(1H, s), 8.75(1H, s)

依照前述實施例製造之本發明化合物[I]之物性值, 包
含前述實施例, 顯示於表64~表72。

【表 64】

化合物編號	熔點 (°C) 或 折射率 (n_D^{20})
I-1	1.525
I-4	1.505
I-5	1.500
I-6	1.497
I-7	1.498
I-8	1.496
I-9	1.497
I-11	1.494
I-13	1.495
I-14	1.495
I-15	1.495
I-16	1.517
I-18	1.516
I-19	1.514
I-21	1.515
I-22	30-32
I-29	1.495
I-47	1.511
I-48	48-51
I-49	1.502
I-50	1.498
I-51	1.500
I-52	1.498
I-53	1.497
I-54	53-54
I-55	1.498
I-56	1.496
I-57	1.492
I-58	1.496
I-59	1.496
I-60	1.4950
I-61	1.488
I-62	1.515
I-64	1.514
I-67	1.512
I-68	1.517
I-69	1.522
I-70	182-184
I-71	179-181

化合物編號	熔點 (°C) 或 折射率 (n_D^{20})
I-72	145-147
I-73	165-168
I-74	109-110
I-75	115-117
I-76	97-99
I-77	128-131
I-78	92-93
I-79	126-127
I-80	107-108
I-81	80-82
I-82	100-102
I-83	100-101
I-84	93-95
I-85	103-106
I-87	136-138
I-90	145-146
I-91	162-163
I-92	133-135
I-96	1.490
I-98	1.489
I-110	1.505
I-119	1.508
I-121	65-67
I-124	1.509
I-128	1.504
I-129	1.505
I-130	68-71
I-131	68-70
I-133	52-54
I-134	1.525
I-136	1.529
I-142	1.509
I-165	1.489
I-167	1.488
I-179	1.504
I-186	144-147
I-188	156-158
I-190	173-176
I-199	145-148

【表 65】

化合物編號	熔點 (°C)或 折射率 (n_D^{20})
I-208	120-123
I-209	70-73
I-210	1.506
I-211	1.503
I-212	114-117
I-213	163-166
I-214	112-115
I-215	72-75
I-217	118-121
I-218	131-134
I-219	1.504
I-220	1.497
I-221	68-71
I-223	93-96
I-224	178-181
I-225	118-119
I-226	89-90
I-228	48-51
I-230	30
I-231	1.479
I-233	1.493
I-234	51-52
I-235	1.490
I-236	1.468
I-237	126-128
I-238	1.462
I-239	1.548
I-240	1.545
I-241	142-144
I-242	1.510
I-243	1.498
I-244	1.500
I-245	1.503
I-246	1.492
I-247	1.503
I-248	1.523
I-249	1.530
I-250	1.520
I-251	96-99

化合物編號	熔點 (°C)或 折射率 (n_D^{20})
I-254	1.552
I-255	165-168
I-256	139-140
I-257	69-72
I-258	1.495
I-259	1.501
I-260	1.492
I-261	1.503
I-262	76-78
I-263	1.502
I-264	81-82
I-266	1.512
I-267	1.492
I-268	110-113
I-269	1.517
I-270	1.504
I-271	86-88
I-272	139-142
I-273	1.495
I-274	65-67
I-275	165-168
I-278	125-127
I-279	140-142
I-280	195-198
I-282	136-139
I-283	110-113
I-284	94-97
I-285	108-110
I-286	1.516
I-287	111-113
I-288	1.496
I-289	70-72
I-290	169-172
I-296	1.512
I-297	110-112
I-298	1.521
I-299	95-98
I-300	1.534
I-301	112-114

【表 66】

化合物編號	熔點 (°C) 或 折射率: (n_D^{20})
I-302	110-112
I-304	121-123
I-305	76-78
I-306	146-149
I-307	1.516
I-308	169-171
I-309	1.500
I-310	99-102
I-311	1.536
I-313	55-58
I-314	83-86
I-315	111-114
I-316	1.518
I-318	1.499
I-319	121-122
I-320	1.481
I-321	150-151
I-322	73-76
I-323	1.505
I-324	54-57
I-325	1.510
I-326	96-97
I-327	94-96
I-329	1.511
I-330	131-133
I-331	1.508
I-332	130-132
I-333	1.550
I-334	141-142
I-335	72-73
I-336	141-142
I-337	1.545
I-338	162-163
I-339	1.541
I-340	94-95
I-341	1.539
I-342	99-100
I-343	1.535
I-345	66-69
I-346	1.5290
I-347	1.5460
I-348	1.5480
I-349	132-135
I-351	1.4870
I-352	81-84

化合物編號	熔點 (°C) 或 折射率: (n_D^{20})
I-353	59-62
I-354	83-86
I-355	1.4890
I-356	86-89
I-357	1.5370
I-358	125-126
I-359	1.4330
I-360	117-119
I-361	1.5130
I-362	113-114
I-363	75-78
I-365	1.5380
I-367	1.5480
I-368	159-162
I-369	1.5140
I-370	123-126
I-371	77-79
I-372	54-57
I-373	123-126
I-374	1.4470
I-375	117-120
I-376	1.4980
I-377	84-85
I-378	1.5360
I-379	1.4700
I-380	123-126
I-381	1.4930
I-382	78-80
I-383	1.5440
I-384	140-143
I-385	1.5440
I-386	148-150
I-387	1.5430
I-388	167-170
I-389	1.5440
I-390	1.5100
I-391	1.4940
I-392	1.4950
I-393	69-72
I-394	57-60
I-395	68-71
I-396	95-98
I-397	83-86
I-398	1.5290

【表 67】

化合物編號	熔點 (°C) 或 折射率 (n_D^{20})
II-4	1.516
II-6	1.508
II-10	1.507
II-15	1.504
II-47	89-90
II-48	71-73
II-49	47-50
II-50	1.509
II-51	1.511
II-52	1.508
II-53	1.507
II-54	85-88
II-55	1.508
II-56	1.507
II-57	1.503
II-58	1.503
II-59	1.507
II-60	1.504
II-61	1.503
II-62	1.524
II-63	1.5240
II-64	1.529
II-65	1.527
II-66	1.524
II-67	1.531
II-68	1.536
II-70	175-178
II-71	174-176
II-72	132-135
II-73	179-182
II-74	134-137
II-75	122-124
II-76	158-161
II-77	41-44
II-78	104-107
II-79	105-106
II-80	156-158
II-81	115-116
II-82	122-125
II-83	79-81
II-84	127-129
II-85	141-144
II-86	97-100

化合物編號	熔點 (°C) 或 折射率 (n_D^{20})
II-87	126-129
II-88	120-123
II-89	105-107
II-90	126-129
II-91	128-131
II-121	77-80
II-125	1.516
II-130	1.512
II-133	110-112
II-185	180-183
II-188	142-144
II-190	153-156
II-194	103-105
II-199	110-113
II-208	87-88
II-214	134-137
II-215	105-107
II-221	1.500
II-222	1.526
II-223	1.505
II-224	133-136
II-225	119-122
II-226	1.511
II-227	1.500
II-235	1.499
II-236	1.494
II-237	63-66
II-238	65-67
II-240	1.475
II-241	154-157
II-244	1.564
II-245	123-126
II-246	39-42
II-247	154-157
II-266	1.507
II-267	99-102
II-268	1.517
II-269	1.523
II-271	82-84
II-278	1.523
II-279	118-120
II-280	1.542
II-281	153-155

【表 68】

化合物編號	熔點 (°C)或 折射率 (n_D^{20})	化合物編號	熔點 (°C)或 折射率 (n_D^{20})
II-282	1.532	II-338	48-51
II-283	117-120	II-339	147-150
II-284	1.5270	II-340	1.5710
II-285	109-112	II-341	124-127
II-286	62-65	II-342	101-104
II-287	158-161	II-343	154-157
II-288	1.524	II-344	1.5020
II-289	89-92	II-345	157-159
II-290	175-178	II-346	1.5330
II-299	1.509	II-347	1.5680
II-301	1.503	II-348	146-149
II-302	111-114	II-349	1.4550
II-303	1.522	II-350	110-112
II-304	138-140	II-351	61-64
II-305	1.518	II-352	127-130
II-306	138-140	II-353	1.5440
II-307	1.522	II-354	161-164
II-308	117-119	II-355	1.5080
II-309	1.514	II-356	98-101
II-311	103-104	II-357	1.4740
II-312	1.5020	II-358	92-95
II-313	110-111	II-359	1.4750
II-314	1.5350	II-360	150-153
II-316	1.5300	II-361	1.5040
II-317	154-155	II-362	100-102
II-318	1.5580	II-363	80-83
II-319	1.5090	II-364	153-156
II-320	129-131	II-365	47-49
II-321	1.5150	II-366	103-106
II-322	93-96	II-367	99-102
II-323	132-134	II-368	116-119
II-324	1.4390	II-369	1.5470
II-325	146-149	II-370	133-136
II-326	1.4540	II-371	1.5760
II-327	123-126	II-372	105-108
II-328	1.4760	II-374	130-133
II-329	120-123	II-375	96-97
II-330	1.4560	II-376	104-107
II-331	104-107	II-377	1.5100
II-332	1.5330	II-378	81-84
II-333	135-138	II-379	1.4390
II-334	1.4810	II-380	128-131
II-335	157-158	II-381	148-151

【表 69】

化合物編號	熔點 (°C) 或 折射率 (n_D^{20})
III-4	1.507
III-47	1.521
III-48	85-87
III-49	1.508
III-50	1.505
III-51	1.505
III-52	1.503
III-53	1.501
III-54	70-73
III-55	1.5010
III-56	1.500
III-57	1.498
III-58	1.501
III-59	1.501
III-60	1.501
III-61	1.501
III-62	1.523
III-64	1.519
III-65	1.520
III-66	1.519
III-67	1.521
III-68	1.526
III-70	162-164
III-71	168-171
III-72	155-157
III-73	172-175
III-74	111-114
III-75	134-137
III-76	121-123
III-77	126-129
III-78	95-97
III-79	104-107
III-80	155-156
III-81	61-64
III-82	91-94
III-83	97-100
III-84	82-84
III-85	140-143
III-87	142-145
III-88	112-115
III-89	106-107
III-90	149-152
III-91	141-144
III-233	1.495
III-234	79-82

化合物編號	熔點 (°C) 或 折射率 (n_D^{20})
III-238	72-74
III-239	142-145
III-242	1.556
III-243	120-122
III-262	1.511
III-263	90-93
III-264	109-111
III-265	1.574
III-266	1.570
III-267	95-98
III-268	121-124
III-269	1.535
III-270	162-165
III-272	1.501
III-273	91-93
III-277	1.507
III-278	144-147
III-279	1.505
III-280	76-78
III-281	1.512
III-282	92-95
III-283	1.532
III-285	1.514
III-287	1.499
III-288	121-122
III-289	1.515
III-290	100-103
III-293	1.517
III-294	101-104
III-295	1.4980
III-296	102-104
III-297	1.4370
III-298	114-117
III-299	1.4470
III-300	1.5050
III-301	147-150
III-302	1.5140
III-303	106-107
III-304	1.4510
III-305	150-152
III-306	1.4990
III-307	1.4970
III-308	1.4410
III-309	88-91

【表 70】

化合物編號	熔點 (°C) 或 折射率 (n_D^{20})
IV-4	1.495
IV-6	1.516
IV-14	1.495
IV-15	129-131
IV-17	136-139
IV-18	95-98
IV-19	74-77
IV-20	119-120
IV-21	141-142
IV-22	125-128
IV-23	136-138
IV-24	172-174
IV-25	165-168
IV-27	75-78
IV-30	1.502
IV-32	1.495
IV-33	1.499
IV-34	1.493
IV-35	1.496
IV-36	1.514
IV-37	1.512
IV-38	1.520
IV-39	1.524
IV-40	1.467
IV-42	1.496
IV-59	133-134
IV-61	135-136
IV-62	211-214
IV-63	127-128
IV-64	159-162
IV-65	132-135
IV-71	102-103
IV-74	1.515
IV-76	1.506
IV-77	74-76
IV-78	1.503
IV-79	1.529
IV-80	1.527
IV-86	1.510

化合物編號	熔點 (°C) 或 折射率 (n_D^{20})
IV-89	60-62
IV-90	1.504
IV-91	1.501
IV-92	1.500
IV-93	1.501
IV-95	1.517
IV-96	1.515
IV-97	1.524
IV-98	1.472
IV-99	1.555
IV-100	138-141
IV-101	127-128
IV-102	105-106
IV-103	122-125
IV-104	86-88
IV-106	123-126
IV-107	131-133
IV-108	121-124
IV-109	159-160
IV-110	107-109
IV-111	1.493
IV-112	114-116
IV-113	1.511
IV-114	147-150
IV-115	1.492
IV-116	45-48
IV-117	1.530
IV-118	154-156
IV-119	1.529
IV-120	111-113
IV-122	130-132
IV-127	1.539
IV-128	144-147
IV-129	1.506
IV-130	1.525
IV-131	1.508
IV-132	122-125
IV-133	132-133
IV-134	103-104

【表 71】

化合物編號	熔點 (°C) 或 折射率 (n_D^{20})
IV-135	83-86
IV-146	1.518
IV-147	1.539
IV-148	1.522
IV-149	1.510
IV-151	171-173
IV-153	110-112
IV-155	1.572
IV-164	1.520
IV-165	129-131
IV-164	1.499
IV-165	85-86
IV-166	1.498
IV-167	166-167
IV-168	1.495
IV-169	116-117
IV-170	1.494
IV-171	79-81
IV-172	1.494
IV-173	63-66
IV-174	1.4940
IV-175	92-95
IV-176	1.4980
IV-177	108-111
IV-178	148-151
IV-179	1.4520
IV-180	129-130
IV-181	75-77
IV-182	82-85
IV-183	1.4380
IV-184	86-87
IV-185	1.4210
V-10	143-145
V-181	1.466
V-182	113-115
VI-26	1.482
VI-27	42-45
VI-28	1.481
VI-30	1.479
VI-31	1.473
VI-32	1.4850

化合物編號	熔點 (°C) 或 折射率 (n_D^{20})
VI-34	1.477
VI-37	1.4830
VI-39	1.500
VI-41	1.494
VI-44	1.497
VI-45	1.497
VI-46	1.512
VI-51	1.470
VI-63	1.486
VI-89	56-58
VI-99	1.496
VI-110	34-35
VI-153	96-98
VI-155	1.491
VI-156	34-36
VI-157	1.490
VI-161	1.487
VI-163	51-54
VI-166	1.484
VI-172	1.526
VI-173	48-50
VI-194	1.492
VI-195	1.488
VI-200	1.499
VI-202	31-32
VI-203	1.442
VI-206	1.511
VI-207	1.513
VI-208	87-89
VI-209	1.492
VI-211	1.499
VI-213	1.484
VI-215	1.539
VI-216	51-53
VI-218	1.478
VI-219	1.492
VI-220	148-151
VI-221	1.468
VI-222	1.562
VI-223	1.540
VI-224	89-92

【表 72】

化合物編號	熔點 (°C)或 折射率 (n_D^{20})	化合物編號	熔點 (°C)或 折射率 (n_D^{20})
VI-225	103-106	VI-266	1.482
VI-226	58-61	VI-269	116-118
VI-227	36-37	VI-270	1.5490
VI-228	82-83	VI-271	1.5380
VI-229	98-99	VI-273	1.4770
VI-230	1.5150	VI-275	58-60
VI-231	86-88	VI-277	1.5260
VI-232	1.483	VI-278	1.5030
VI-233	1.505	VI-279	89-91
VI-234	1.519	VI-280	1.5360
VI-235	1.492	VI-286	1.5050
VI-236	97-98	VI-288	1.4170
VI-237	97-98	VI-290	1.4110
VI-238	1.499	VI-291	50-52
VI-239	1.498	VI-292	34-35
VI-240	1.540	VI-294	31-34
VI-241	57-59	VI-295	72-74
VI-242	1.546	VI-296	1.4840
VI-243	1.536	VI-297	1.5520
VI-244	1.533	VI-301	1.4240
VI-245	1.529	VI-302	51-52
VI-246	1.530	VI-303	1.4510
VI-247	1.505	VI-305	67-69
VI-248	1.480	VI-306	50-53
VI-249	40-42	VI-308	1.4820
VI-250	1.494	VI-309	1.4490
VI-251	1.505	VI-310	1.4830
VI-252	1.499	VI-311	66-69
VI-253	1.495	VI-312	69-72
VI-254	54-57	VI-313	85-87
VI-255	1.475	VI-315	97-98
VI-256	1.478	VII-4	130-133
VI-257	1.481	VII-27	198-201
VI-258	1.503	VII-51	192-195
VI-261	1.515	VII-141	70-73
VI-263	1.506	VII-164	204-207
VI-264	1.509		

又，關於化合物編號 I-120、I-229、I-265、I-281、
I-312、II-232、II-336、II-373、III-284、IV-1、IV-11、
IV-121、IV-152、VI-25、VI-29、VI-33、VI-38、VI-47、
VI-53、VI-93、VI-96、VI-97、VI-103、VI-196、VI-197、

VI-198、VI-199、VI-201、VI-204、VI-205、VI-210、VI-212、
 VI-214、VI-217、VI-259、VI-260、VI-262、VI-265、VI-267、
 VI-268、VI-272、VI-274、VI-276、VI-281、VI-282、VI-283、
 VI-284、VI-285、VI-287、VI-289、VI-293、VI-298、VI-299、
 VI-300、VI-304、VI-307 及 VI-314, ^1H -NMR 數據 (TMS/ δ (ppm)
 值) 如以下所示。

化合物編號 I-120(CDCl_3): 0.91(3H, t), 1.29(6H, d),
 1.30-1.41(2H, m), 1.55-1.64(2H, m), 4.00(2H, t),
 4.52(1H, sept), 4.95(1H, s), 8.07(1H, s), 8.40(1H, s)

化合物編號 I-229(CDCl_3): 1.30-1.41(12H, m),
 4.56-4.70(2H, m), 8.01(1H, s), 9.20(1H, s)

化合物編號 I-265(CDCl_3): 0.92(9H, s),
 1.28-1.33(9H, m), 1.60(2H, t), 4.25-4.32(4H, m),
 4.59(1H, sept), 8.04(1H, s), 8.74(1H, s)

化合物編號 I-281(CDCl_3): 1.36(6H, d), 1.71(3H, d),
 4.60(1H, sept), 5.49(1H, q), 5.94(1H, s),
 7.36-7.39(6H, m), 7.94(1H, s), 9.14(1H, s)

化合物編號 I-312(CDCl_3): 1.20-1.49(12H, m),
 3.69(2H, s), 4.50-4.80(2H, m), 7.87 及 7.94(1H, s), 9.29
 及 9.49(1H, s)

化合物編號 II-232(CDCl_3): 1.01(6H, d),
 1.27(9H, s), 4.08(3H, s), 4.23(1H, sept), 7.93(1H, s),
 9.11(1H, s)

化合物編號 II-336(CDCl_3): 4.27(3H, s),

5.01-5.22(1H, m), 8.13(1H, s), 8.78(1H, s)

化合物編號 II-373(CDC1₃): 4.18(3H, s),
4.79(2H, t), 7.16(2H, m), 7.79(1H, s)

化合物編號 III-284(CDC1₃): 1.43(3H, t),
1.75-1.81(2H, m), 2.05-2.18(1H, m), 4.38-4.63(4H, m),
6.02(1H, s), 7.26(1H, s), 7.98(1H, s), 9.17(1H, s)

化合物編號 IV-1(CDC1₃): 0.96(3H, t), 1.31(6H, d),
1.73-1.81(2H, m), 4.29(2H, t), 4.54(1H, sept),
8.07(1H, s), 8.73(1H, s)

化合物編號 IV-11(CDC1₃): 1.33(6H, d), 3.40(3H, s),
3.70(2H, t), 4.40-4.58(3H, m), 8.07(1H, s), 8.85(1H, s)

化合物編號 IV-121(CDC1₃): 4.19(3H, s),
5.35(2H, s), 7.39(5H, s), 8.07(1H, s), 8.65(1H, s)

化合物編號 IV-152(CDC1₃): 0.92(6H, d),
1.56-1.72(3H, m), 4.03(3H, s), 4.27(2H, t), 6.09(1H, s),
6.46(1H, s), 7.07(1H, s), 7.30(1H, s), 7.89(1H, s)

化合物編號 VI-25(CDC1₃): 1.37(6H, d), 1.41(3H, t),
4.50(2H, q), 4.63(1H, sept)

化合物編號 VI-29(CDC1₃): 0.99(6H, d), 1.38(6H, d),
2.04-2.18(1H, m), 4.21(2H, d), 4.63(1H, sept)

化合物編號 VI-33(CDC1₃): 0.97(6H, d), 1.38(6H, d),
1.57-1.82(3H, m), 4.47(2H, t), 4.63(1H, sept)

化合物編號 VI-38(CDC1₃): 0.97(9H, d), 1.37(6H, d),
1.72(2H, t), 4.52(2H, t), 4.62(1H, sept)

化 合 物 編 號 VI-47(CDC1₃):1.38(6H, d) ,
4.65-4.80(3H, m)

化 合 物 編 號 VI-53(CDC1₃):0.94(6H, d) , 1.33(6H, d) ,
1.99-2.12(1H, m) , 2.13(3H, s) , 4.00(2H, d) , 4.51(1H, sept)

化 合 物 編 號 VI-93(CDC1₃):0 . 96(3H, t) ,
1.36(3H, t) , 1.40-1.49(2H, m) , 1.70-1.81(2H, m) ,
4.35-4.46(4H, m)

化 合 物 編 號 VI-96(CDC1₃):1.39(3H, t) , 1.41(9H, s) ,
4.40(2H, q)

化 合 物 編 號 VI-97(CDC1₃):0 . 92(3H, t) ,
1.36-1.41(7H, m) , 1.74-1.81(2H, m) , 4.37-4.46(4H, m)

化 合 物 編 號 VI-103(CDC1₃):0.97(9H, s) , 1.39(3H, t) ,
1.72(2H, t) , 4.41(2H, q) , 4.51(2H, t)

化 合 物 編 號 VI-196(CDC1₃):0.98(3H, t) ,
1.39(6H, d) , 1.73-1.85(2H, m) , 4.31(2H, t) , 4.71(1H, sept)

化 合 物 編 號 VI-197(CDC1₃):0.95-1.00(6H, m) ,
1.40-1.49(2H, m) , 1.74-1.84(4H, m) , 4.31(2H, t) ,
4.45(2H, t)

化 合 物 編 號 VI-198(CDC1₃):0.36-0.67(4H, m) ,
0.98(3H, t) , 1.22-1.31(1H, m) , 1.74-1.85(2H, m) ,
4.26(2H, d) , 4.31(1H, t)

化 合 物 編 號 VI-199(CDC1₃):0.95-1.00(6H, m) ,
1.36(3H, d) , 1.61-1.87(4H, m) , 4.31(2H, t) ,
4.47-4.55(1H, m)

化 合 物 編 號 VI-201(CDC1₃):0.98(3H, t) ,
1.73-1.85(2H, m) , 4.32(2H, t) , 4.91(2H, d) ,
5.34-5.49(2H, m) , 5.96-6.09(1H, m)

化 合 物 編 號 VI-204(CDC1₃):0.97(6H, d) ,
2.10(1H, sept) , 4.14(2H, d) , 4.25(3H, s)

化 合 物 編 號 VI-205(CDC1₃):0.95(6H, d) ,
1.63-1.78(3H, m) , 4.25(3H, s) , 4.40(2H, t)

化 合 物 編 號 VI-210(CDC1₃):1.39(6H, d) ,
4.71(1H, sep) , 4.83(2H, d) , 5.32-5.42(2H, m) ,
5.98-6.08(1H, m)

化 合 物 編 號 VI-212(CDC1₃):1.41(6H, d) ,
4.65-4.84(3H, m)

化 合 物 編 號 VI-214(CDC1₃):0.35-0.67(4H, m) ,
1.19-1.31(2H, m) , 4.17(2H, d) , 4.26(2H, d)

化 合 物 編 號 VI-217(CDC1₃):1.40(9H, s) ,
4.70(1H, sept)

化 合 物 編 號 VI-259(CDC1₃):1.40(3H, t) ,
3.54(3H, s) , 4.43(2H, q) , 5.4(2H, s)

化 合 物 編 號 VI-260(CDC1₃):1.39(3H, t) ,
2.04-2.08(2H, m) , 3.35(3H, s) , 3.50(2H, t) , 4.41(2H, q) ,
4.54(2H, t)

化 合 物 編 號 VI-262(CDC1₃):1.40(3H, t) ,
1.55-1.66(2H, m) , 2.04-2.14(1H, m) , 4.43(2H, q) ,
4.39-4.59(2H, m)

化合物編號 VI-265(CDC1₃): 1.92-1.97(2H, m) ,
2.23(6H, s) , 2.37-2.40(2H, t) , 3.88 及 4.17(3H, s) ,
4.42, 4.50(2H, s)

化合物編號 VI-267(CDC1₃): 1.40(9H, s) ,
1.41(3H, t) , 4.49(2H, q)

化合物編號 VI-268(CDC1₃): 1.00(3H, t) ,
1.40(9H, s) , 1.82(2H, m) , 4.39(2H, t)

化合物編號 VI-272(CDC1₃): 0.89(3H, t) ,
1.20-1.43(16H, m) , 1.74-1.81(2H, m) , 4.42(2H, t) ,
4.63(1H, sept)

化合物編號 VI-274(CDC1₃): 0.85(3H, t) ,
0.96(6H, s) , 1.26-1.43(5H, m) , 4.20(2H, s) , 4.41(2H, q)

化合物編號 VI-276(CDC1₃): 1.40(3H, t) ,
4.45(2H, q) , 4.90(2H, t)

化合物編號 VI-281(CDC1₃): 0.97(3H, t) ,
1.01(9H, s) , 1.73-1.85(1H, m) , 4.11(2H, s) , 4.31(2H, t)

化合物編號 VI-282(CDC1₃): 0.92-1.01(9H, m) ,
1.65-1.85(5H, m) , 4.31(2H, t) , 4.48(2H, t)

化合物編號 VI-283(CDC1₃): 1.43(3H, t) ,
4.53(2H, q) , 5.07-5.27(1H, m)

化合物編號 VI-284(CDC1₃): 1.36(6H, d) ,
1.78(6H, d) , 4.61(2H, sept) , 4.65-4.92(2H, m)
5.45-5.49(1H, m)

化合物編號 VI-285(CDC1₃): 1.47(6H, s) ,

4.19(3H, s), 4.43(2H, s)

化合物編號 VI-287(CDC1₃):1.10(6H, s),
1.39(3H, t), 3.48(2H, s), 4.33(3H, s), 4.43(2H, q)

化合物編號 VI-289(CDC1₃):4.20(3H, s), 4.90(2H, t)

化合物編號 VI-293(CDC1₃):4.26(3H, s),
5.08-5.26(1H, m)

化合物編號 VI-298(CDC1₃):0.97(3H, t),
1.76-1.85(2H, m), 4.35(2H, t), 4.86(2H, t)

化合物編號 VI-299(CDC1₃):1.38(6H, d), 4.67(1H, sept),
4.85(2H, t)

化合物編號 VI-300(CDC1₃):1.23(3H, t),
1.37(6H, d), 3.56(2H, q), 3.78(2H, t), 4.57(2H, t),
4.67(1H, sept)

化合物編號 VI-304(CDC1₃):4.79(2H, q),
5.46(2H, s), 7.40(5H, s)

化合物編號 VI-307(CDC1₃):1.60(3H, d), 4.19(3H, s),
4.90(1H, sept)

化合物編號 VI-314(CDC1₃):1.18(6H, d),
1.35(6H, d), 3.63(1H, sept), 3.75-3.77(2H, m),
4.54-4.56(2H, m), 4.63(1H, sept)

其次舉代表的製劑例具體說明製劑方法。化合物、添加劑種類及配合比率，不僅限於此，而可在廣範圍內改變。又，於以下的說明中，「份」意指質量份。

[製劑例 1]乳劑

表 1~表 51 記載之化合物	10 份
環己酮	30 份
聚氧化乙烯烷基芳基醚	11 份
烷基苯磺酸鈣	4 份
甲基萘	45 份

以上均勻溶解成乳劑。

[製劑例 2]水合劑

表 1~表 51 記載之化合物	10 份
萘磺酸福馬林縮合物鈉鹽	0.5 份
聚氧化乙烯烷基芳基醚	0.5 份
矽藻土	24 份
黏土	65 份

以上均勻混合粉碎成水合劑。

[製劑例 3]粉劑

表 1~表 51 記載之化合物	2 份
矽藻土	5 份
黏土	93 份

以上均勻混合粉碎成粉劑。

[製劑例 4]粒劑

表 1~表 51 記載之化合物	5 份
月桂醇硫酸酯之鈉鹽	2 份
木質素磺酸鈉	5 份
羧基甲基纖維素	2 份
黏土	86 份

將以上成分均勻混合粉碎。於該混合物中加入相當於水 20 份的量並揉合，使用擠壓式造粒機，加工為 14~32mesh 之粒狀後，乾燥成粒劑。

其次，針對以本發明化合物當做有效成分的有害生物防除劑發揮的效果，舉試驗例說明。

[試驗例 1] 蚜蟲殺蟲試驗

將依據製劑例 2 調製的水合劑，以水稀釋成有效成分為 500ppm 的濃度。於該稀釋藥液中，浸漬有蚜蟲的孵化幼蟲寄生的胡瓜苗並風乾。將處理後的胡瓜苗放置在 25℃ 的恆溫室，3 日後計算生存蟲數，以數 1 之計算式求取死蟲率。

【數 1】

$$\text{死蟲率：(\%)} = \left(1 - \frac{\text{生存蟲數}}{\text{供試蟲數}} \right) \times 100$$

該試驗中顯示 90% 以上的死蟲率的化合物，如以下所示。

I-1, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-11, I-13, I-14, I-15, I-18, I-19, I-21, I-22, I-29, I-48, I-49, I-50, I-52, I-54, I-55, I-56, I-57, I-58, I-59, I-60, I-61, I-62, I-64, I-67, I-68, I-69, I-71, I-72, I-75, I-76, I-78, I-80, I-81, I-87, I-98, I-110, I-120, I-121, I-124, I-128, I-129, I-130, I-131, I-134, I-136, I-142, I-165, I-167, I-179, I-190, I-208, I-209, I-212, I-214,

I-215, I-217, I-223, I-224, I-228, I-229, I-230, I-235,
 I-236, I-239, I-240, I-243, I-246, I-247, I-249, I-250,
 I-257, I-258, I-259, I-260, I-267, I-269, I-270, I-271,
 I-273, I-274, I-281, I-286, I-288, I-289, I-296, I-298,
 I-300, I-301, I-302, I-305, I-307, I-309, I-311, I-318,
 I-319, I-323, I-324, I-331, I-333, I-335, I-339, I-343,
 I-345, I-347, I-348, I-351, I-355, I-357, I-358, I-358,
 I-359, I-360, I-361, I-363, I-365, I-367, I-369, ,
 I-370, I-371, I-372, I-374, I-375, I-376, I-379, I-381,
 I-383, I-385, I-387, I-393, I-395, I-396, I-397, II-4,
 II-6, II-10, II-15, II-48, II-49, II-51, II-52, II-53,
 II-54, II-55, II-56, II-57, II-58, II-59, II-60, II-61,
 II-62, II-63, II-64, II-65, II-66, II-67, II-68, II-71,
 II-72, II-73, II-76, II-77, II-78, II-79, II-80, II-81,
 II-82, II-83, II-86, II-87, II-88, II-89, II-91, II-130,
 II-133, II-188, II-190, II-194, II-199, II-208, II-214,
 II-215, II-221, II-222, II-223, II-224, II-225, II-226,
 II-235, II-236, II-240, II-241, II-244, II-246, II-266,
 II-267, II-271, II-278, II-280, II-281, II-284, II-285,
 II-288, II-289, II-301, II-302, II-303, II-304, II-306,
 II-309, II-311, II-312, II-313, II-314, II-316, II-317,
 II-318, II-319, II-320, II-321, II-322, II-324, II-325,
 II-326, II-327, II-328, II-329, II-330, II-331, II-332,
 II-333, II-334, II-335, II-338, II-340, II-342, II-343,

II-344, II-345, II-346, II-349, II-351, II-352, II-353, II-355, II-356, II-357, II-359, II-360, II-361, II-365, II-367, II-369, II-371, II-373, II-374, II-375, II-376, II-377, II-378, II-379, III-4, III-48, III-49, III-50, III-51, III-53, III-54, III-55, III-56, III-57, III-58, III-59, III-60, III-61, III-62, III-64, III-65, III-66, III-67, III-68, III-70, III-71, III-72, III-73, III-76, III-77, III-78, III-79, III-80, III-81, III-82, III-83, III-84, III-85, III-87, III-88, III-90, III-233, III-238, III-239, III-242, III-262, III-269, III-272, III-273, III-277, III-279, III-280, III-281, III-282, III-283, III-284, III-287, III-288, III-289, III-290, III-295, III-296, III-297, III-298, III-300, III-301, III-302, III-303, III-304, III-305, III-306, III-307, III-308, III-309, IV-1, IV-6, IV-22, IV-30, IV-33, IV-36, IV-37, IV-38, IV-39, IV-79, IV-89, IV-90, IV-91, IV-92, IV-95, IV-97, IV-98, IV-99, IV-102, IV-104, IV-107, IV-115, IV-117, IV-119, IV-152, IV-164, IV-164, IV-170, IV-172, IV-176, IV-177, IV-178, IV-179, IV-180, IV-181, V-10, VI-96, VI-199, VI-217, VI-221, VI-222, VI-223, VI-269, VI-276, VI-291, VI-297

[試驗例 2] 蚜蟲殺蟲試驗

將依據製劑例 2 調製之水合劑，以水稀釋成有效成分成為 500ppm 的濃度。將該稀釋藥劑液對於有蚜蟲的孵化幼

蟲寄生的胡瓜苗的地際部灌注處理 5ml。將處理後的胡瓜苗放置在 25℃ 的恆溫室，3 日後計算生存蟲數，以數 1 之計算式求取死蟲率。

該試驗中顯示 90% 以上的死蟲率的化合物，如以下所示。

I-4, I-5, I-55, I-233, II-57, II-63, II-64, II-80, II-301, II-316, II-326, II-332, II-334, II-346, II-367, II-371, III-49, III-60, III-61, III-64, III-68, III-87, III-281, III-283, III-287, III-300, III-304, IV-95

[試驗例 3] 褐飛蝨殺蟲試驗

將依據製劑例 2 調製之水合劑，以水稀釋成有效成分為 500ppm 之濃度。於該稀釋藥液中，浸漬稻米的發芽的粗糠，並放入容量 60mL 的塑膠杯。於該塑膠杯裝放入 10 隻褐飛蝨 3 齡幼蟲，加蓋並放置於 25℃ 的恆溫室。6 日後計算生存蟲數，以數 1 之計算式求取死蟲率。

該試驗中顯示 90% 以上之死蟲率的化合物，如以下所示。

I-1, I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-11, I-13, I-14, I-15, I-16, I-18, I-19, I-21, I-22, I-29, I-47, I-48, I-49, I-50, I-51, I-52, I-53, I-54, I-55, I-56, I-57, I-58, I-59, I-60, I-61, I-62, I-64, I-67, I-68, I-69, I-70, I-71, I-72, I-73, I-74, I-75, I-76, I-77, I-78, I-79, I-80, I-81, I-82, I-83, I-84, I-85, I-87, I-90, I-91, I-92, I-96, I-98, I-110, I-119, I-120, I-121,

I-124, I-128, I-129, I-130, I-131, I-133, I-134, I-136,
I-142, I-165, I-167, I-179, I-186, I-188, I-190, I-199,
I-208, I-209, I-210, I-211, I-212, I-213, I-214, I-215,
I-217, I-218, I-219, I-220, I-221, I-223, I-224, I-225,
I-226, I-228, I-229, I-230, I-231, I-233, I-234, I-235,
I-236, I-237, I-239, I-240, I-241, I-242, I-243, I-244,
I-245, I-246, I-247, I-249, I-250, I-251, I-254, I-255,
I-256, I-257, I-258, I-259, I-260, I-261, I-262, I-263,
I-264, I-265, I-266, I-267, I-268, I-269, I-270, I-271,
I-272, I-273, I-274, I-275, I-278, I-279, I-281, I-282,
I-285, I-286, I-287, I-288, I-289, I-290, I-296, I-297,
I-298, I-299, I-300, I-301, I-302, I-304, I-305, I-306,
I-307, I-308, I-309, I-310, I-311, I-312, I-313, I-315,
I-318, I-319, I-321, I-322, I-323, I-324, I-327, I-331,
I-332, I-333, I-335, I-336, I-339, I-343, I-345, I-346,
I-347, I-348, I-351, I-353, I-354, I-355, I-357, I-358,
I-359, I-360, I-361, I-365, I-367, I-369, I-370, I-371,
I-372, I-373, I-374, I-375, I-376, I-377, I-378, I-379,
I-380, I-381, I-382, I-383, I-384, I-385, I-386, I-387,
I-389, I-390, I-391, I-392, I-393, I-394, I-395, I-396,
I-397, I-398, II-4, II-6, II-10, II-15, II-47, II-48,
II-49, II-50, II-51, II-52, II-53, II-54, II-55, II-56,
II-57, II-58, II-59, II-60, II-61, II-62, II-63, II-64,
II-65, II-66, II-67, II-68, II-70, II-71, II-72, II-73,

II-74, II-75, II-76, II-77, II-78, II-79, II-80, II-81,
II-82, II-83, II-84, II-85, II-86, II-87, II-88, II-89,
II-90, II-91, II-121, II-125, II-130, II-133, II-185,
II-188, II-190, II-194, II-199, II-208, II-214, II-215,
II-221, II-222, II-223, II-224, II-225, II-226, II-227,
II-232, II-235, II-236, II-238, II-240, II-241, II-244,
II-245, II-246, II-247, II-266, II-267, II-268, II-269,
II-271, II-278, II-279, II-280, II-281, II-282, II-283,
II-284, II-285, II-286, II-288, II-289, II-301, II-302,
II-303, II-304, II-306, II-311, II-312, II-313, II-314,
II-316, II-317, II-318, II-319, II-320, II-321, II-322,
II-323, II-324, II-325, II-326, II-327, II-328, II-329,
II-330, II-331, II-332, II-333, II-334, II-335, II-336,
II-338, II-339, II-340, II-341, II-342, II-343, II-344,
II-345, II-346, II-347, II-348, II-349, II-350, II-351,
II-352, II-353, II-354, II-355, II-356, II-357, II-358,
II-359, II-360, II-361, II-362, II-365, II-366, II-367,
II-368, II-369, II-370, II-371, II-372, II-373, II-374,
II-375, II-376, II-377, II-378, II-379, II-380, II-381,
III-4, III-47, III-48, III-49, III-50, III-51, III-52,
III-53, III-54, III-55, III-56, III-57, III-58, III-59,
III-60, III-61, III-62, III-64, III-65, III-66, III-67,
III-68, III-70, III-71, III-72, III-73, III-74, III-75,
III-76, III-77, III-78, III-79, III-80, III-81, III-82,

III-83, III-84, III-85, III-87, III-88, III-89, III-90,
III-91, III-233, III-234, III-238, III-239, III-242,
III-243, III-262, III-263, III-264, III-266, III-267,
III-269, III-270, III-272, III-273, III-279, III-280,
III-281, III-282, III-283, III-284, III-287, III-288,
III-289, III-290, III-295, III-296, III-297, III-298,
III-299, III-300, III-301, III-302, III-303, III-304,
III-305, III-306, III-307, III-308, III-309, IV-1,
IV-4, IV-6, IV-11, IV-14, IV-15, IV-17, IV-18, IV-19,
IV-20, IV-21, IV-22, IV-23, IV-25, IV-27, IV-30, IV-32,
IV-33, IV-34, IV-35, IV-36, IV-37, IV-38, IV-39, IV-40,
IV-42, IV-59, IV-61, IV-62, IV-64, IV-65, IV-74, IV-76,
IV-77, IV-78, IV-79, IV-80, IV-86, IV-89, IV-90, IV-91,
IV-92, IV-93, IV-95, IV-96, IV-97, IV-98, IV-99, IV-100,
IV-101, IV-102, IV-103, IV-104, IV-106, IV-107, IV-108,
IV-109, IV-110, IV-111, IV-112, IV-113, IV-114, IV-115,
IV-116, IV-117, IV-118, IV-119, IV-120, IV-127, IV-129,
IV-130, IV-131, IV-133, IV-134, IV-135, IV-146, IV-147,
IV-149, IV-164, IV-165, IV-164, IV-165, IV-166, IV-167,
IV-168, IV-169, IV-170, IV-171, IV-172, IV-173, IV-176,
IV-177, IV-178, IV-179, IV-180, IV-181, IV-182, IV-183,
IV-184, IV-185, IV-186, IV-187, V-10, V-181, VI-25,
VI-26, VI-27, VI-28, VI-29, VI-30, VI-31, VI-32, VI-33,
VI-34, VI-37, VI-38, VI-39, VI-41, VI-44, VI-45, VI-46,

VI-53, VI-63, VI-89, VI-93, VI-96, VI-97, VI-99, VI-103, VI-110, VI-153, VI-155, VI-156, VI-157, VI-161, VI-163, VI-166, VI-172, VI-173, VI-194, VI-195, VI-196, VI-197, VI-198, VI-199, VI-200, VI-201, VI-202, VI-203, VI-204, VI-205, VI-206, VI-207, VI-209, VI-210, VI-211, VI-213, VI-214, VI-215, VI-217, VI-218, VI-221, VI-222, VI-223, VI-230, VI-232, VI-233, VI-234, VI-235, VI-239, VI-244, VI-246, VI-247, VI-248, VI-250, VI-255, VI-256, VI-257, VI-258, VI-259, VI-260, VI-261, VI-262, VI-263, VI-264, VI-267, VI-268, VI-274, VI-275, VI-277, VI-278, VI-281, VI-282, VI-283, VI-284, VI-286, VI-287, VI-290, VI-292, VI-294, VI-297, VI-300, VI-302, VI-303, VI-304, VI-305, VI-306, VI-307, VI-308, VI-309, VI-310, VI-314, VII-164

[試驗例 4] 褐飛蝨滲透移行性殺蟲試驗

將依據製劑例 2 調製之水合劑，以水稀釋成有效成分為 1800ppm 的濃度。將該稀釋藥液對於育苗至 2.5 葉期的紙盆栽植的稻米的地際部(紙盆尺寸:縱 1.5cm×橫 1.5cm×高 3cm)灌注處理 250 μ L，並放入容量 700mL 的塑膠杯。於該塑膠杯中放入 5 隻褐飛蝨 3 齡幼蟲，加蓋並放入 25℃ 的恆溫室。6 日後計算生存蟲數，以數 1 之計算式求取死蟲率。

該試驗顯示 90% 以上的死蟲率的化合物，如以下所示。
I-4, I-5, I-6, I-7, I-8, I-9, I-11, I-13, I-16, I-18, I-19, I-21, I-22, I-48, I-50, I-52, I-53, I-56, I-64,

I-71, I-72, I-74, I-75, I-76, I-87, I-90, I-91, I-96, I-98, I-110, I-133, I-142, I-165, I-167, I-179, I-186, I-190, I-199, I-208, I-218, I-223, I-228, I-229, I-230, I-231, I-233, I-236, I-237, I-246, I-273, II-4, II-6, II-52, II-56, II-61, II-75, II-79, II-81, II-84, II-85, II-199, II-224, II-271, III-4, III-49, III-73, III-75, IV-4, IV-6, IV-25, IV-36, IV-40, IV-101

[試驗例 5] 葉蛾殺蟲試驗

將依據製劑例 2 調製之水合劑，以水稀釋成有效成分為 500ppm 之濃度。於該稀釋藥液中浸漬甘藍葉，風乾後放入容量 60mL 的塑膠杯。於該塑膠杯中放入 10 隻葉蛾的 2 齡幼蟲，加蓋並放置於 25℃ 的恆溫室。6 日後計算生存蟲數，以數 1 之計算式求取死蟲率。

該試驗顯示 90% 以上之死蟲率的化合物，如以下所示。
I-378, II-353, II-355, III-78, IV-121, IV-155, VI-25, VI-28, VI-33, VI-46, VI-63, VI-110, VI-153, VI-172, VI-196, VI-201, VI-210, VI-215, VI-223, VI-232, VI-233, VI-255, VI-256, VI-260, VI-265

[試驗例 6] 番茄葉蛾殺蟲試驗

將依據製劑例 2 調製的水合劑以水稀釋成有效成分為 500ppm 之濃度。於該稀釋藥液中浸漬甘藍葉，風乾後放入容量 60mL 之塑膠杯。於該塑膠杯中放入 5 隻番茄葉蛾的孵化幼蟲，加蓋並放入 25℃ 的恆溫室。6 日後計算生存蟲數，以數 1 之計算式求取死蟲率。



該試驗顯示 90%以上之死蟲率的化合物，如以下所示。

I-374, II-353, III-78, VI-28, VI-46, VI-63, VI-212,
VI-215, VI-222, VI-223, VI-231

【圖式簡單說明】

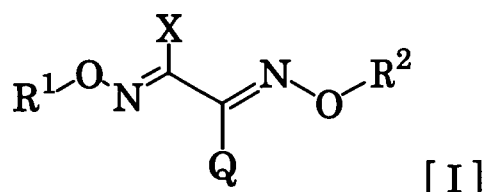
無。

【主要元件符號說明】

無。

七、申請專利範圍：

1. 一種以通式 [I] 表示之烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽，



[式 中，

X 代表氫原子、鹵素原子、氰基、C₁~C₈ 烷基、C₂~C₆ 烯基、C₂~C₆ 炔基、C₃~C₆ 環烷基、C₃~C₆ 環烷基 C₁~C₆ 烷基、C₁~C₆ 鹵烷基、C₁~C₆ 烷硫基、C₁~C₆ 烷基亞磺醯基、C₁~C₆ 烷基磺醯基、C₁~C₆ 烷硫基 C₁~C₆ 烷基、C₁~C₆ 烷基亞磺醯基 C₁~C₆ 烷基、C₁~C₆ 烷基磺醯基 C₁~C₆ 烷基、C₁~C₆ 烷氧基、C₁~C₆ 烷氧基 C₁~C₆ 烷基、硫代胺甲醯基、R⁴R⁵NC(=O)基、R⁶R⁷N 基、C₁~C₆ 烷氧基羰基、羧基、R⁸O(HN=)C 基、R⁹ON=(R¹⁰)C 基、R¹¹S(O=)C 基、R¹²R¹³NSO₂NH 基、羥基 C₁~C₆ 烷基、氰基 C₁~C₆ 烷基、C₁~C₆ 烷基羰基、可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基或具有可相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中 1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環基(該碳數 1 至 9 之雜環基可經 1~5 個鹵素原子、C₁~C₆ 烷基、C₁~C₆ 鹵烷基、C₁~C₆ 烷氧基、側氧基或氰基取代)，

R¹ 代表 C₁~C₁₀ 烷基、C₂~C₆ 烯基、C₂~C₆ 炔基、C₃~C₆ 環烷基、C₃~C₆ 環烷基 C₁~C₆ 烷基、C₁~C₆ 鹵烷基、C₂~C₆ 鹵烯基、C₂~C₆ 鹵炔基、C₁~C₆ 烷硫基 C₁~C₆ 烷基、C₁~C₆ 烷基亞磺醯基 C₁~C₆ 烷基、C₁~C₆ 烷基磺醯基 C₁~C₆ 烷基、C₁~C₆ 烷氧基 C₁~C₆

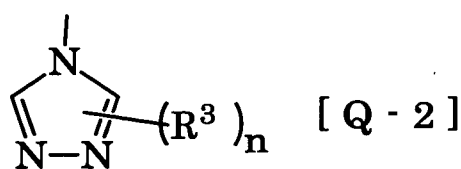
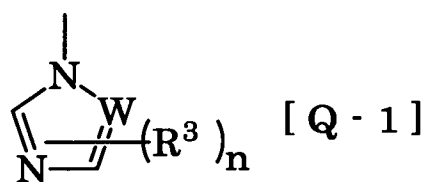
烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基亞胺基 $C_1\sim C_6$ 烷基、三($C_1\sim C_6$ 烷基)甲矽烷基 $C_1\sim C_6$ 烷基、氰基 $C_1\sim C_6$ 烷基、gem-二($C_1\sim C_6$ 烷氧基) $C_1\sim C_6$ 烷基、羥基 $C_1\sim C_6$ 烷基、胺基 $C_1\sim C_6$ 烷基(該烷基可經 R^{14} 、 R^{15} 取代)、可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基、可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基 $C_2\sim C_6$ 烯基、可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯氧基 $C_1\sim C_6$ 烷基、具有可相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中 1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環基(該碳數 1 至 9 之雜環基可經 1~5 個鹵素原子、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基或氰基取代)、經具有可為相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子之 1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環取代之 $C_1\sim C_6$ 烷基(該烷基可經 1~5 個鹵素原子、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基、側氧基或氰基取代)或經具有可為相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中之 1 至 5 個雜原子的碳數 1 至 9 之雜環取代的 $C_2\sim C_6$ 烯基(該烯基可經 1~5 個鹵素原子、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基或氰基取代)，

前述雜環基含有氮原子時，也可經氧化成 N-氧化物，

R^2 代表 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_2\sim C_6$ 烯基、 $C_2\sim C_6$ 炔基、 $C_3\sim C_6$ 環烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_2\sim C_6$ 鹵烯基、 $C_2\sim C_6$ 鹵炔基、 $C_1\sim C_6$ 烷硫基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷基亞磺醯基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷基磺醯基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷氧基 $C_1\sim C_6$ 烷基、或氰基 $C_1\sim C_6$ 烷基，

Q 代表以式 [Q-1] 或式 [Q-2] 表示之雜環基或鹵素原

子，其中該鹵素原子不為溴，



式 [Q-1] 中，W 代表氮原子或亞甲基，

式 [Q-1] 及式 [Q-2] 中所表示之雜環基之氮原子可被氧化成 N-氧化物，

式 [Q-1] 及式 [Q-2] 中， R^3 代表鹵素原子、氰基、硝基、羥基、巰基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 鹵烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷氧基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷硫基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基亞磺醯基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基磺醯基、甲醯基或羥基亞胺基 $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ 烷基，

式 [Q-1] 中，W 為氮原子時，n 代表 0、1 或 2，W 為亞甲基時，n 代表 0、1、2 或 3，式 [Q-2] 中，n 代表 0、1 或 2，

R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 及 R^{15} ，各自代表氫原子、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷氧基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷氧基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基羰基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷氧基羰基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 鹵烷基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ 環烷基、 $\text{C}_3\sim\text{C}_6$ 環烷基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基磺醯基或氰基 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基或可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基，

又， R^4 與 R^5 、 R^6 與 R^7 、 R^{12} 與 R^{13} 及 R^{14} 與 R^{15} ，可一體形成 $\text{C}_2\sim\text{C}_7$ 伸烷基鏈，與鏈結之氮原子一起形成 3~8 員環，該伸烷基鏈也可含有 1 個氧原子、硫原子或氮原子，且該伸烷基鏈也可經鹵素原子、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、側氧基取代，

R^8 及 R^9 各自代表氫原子、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 烷基、 $\text{C}_1\sim\text{C}_6$ 鹵烷基或

$C_1\sim C_6$ 烷氧基羰基，

R^{10} 代表 R^6R^7N 基或 Q ，

R^{11} 代表 $C_1\sim C_6$ 烷基]

「取代基群 α 」

鹵素原子、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷氧基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基羰基、硝基及氰基。

2. 如申請專利範圍第 1 項所述之烷氧亞胺衍生物或其
在農業上可容許之鹽，其中， X 代表氫原子、鹵素原子、
氰基、 $C_1\sim C_8$ 烷基、 $C_3\sim C_6$ 環烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷硫
基、 $C_1\sim C_6$ 烷基亞磺醯基、 $C_1\sim C_6$ 烷基磺醯基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基、
硫代胺甲醯基、 $R^4R^5NC(=O)$ 基、 R^6R^7N 基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基羰
基、羧基、 $R^8O(HN=)C$ 基、 $R^9ON=(R^{10})C$ 基、 $R^{11}S(O=)C$
基、 $R^{12}R^{13}NSO_2NH$ 基、羥基 $C_1\sim C_6$ 烷基、氰基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$
烷基羰基、可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基
或具有選自可相同或相異之氧原子、硫原子及氮原子當中
1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環基（該碳數 1 至 9 之雜
環基可經 1~5 個鹵素原子、 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1\sim C_6$
烷氧基、側氧基或氰基取代），

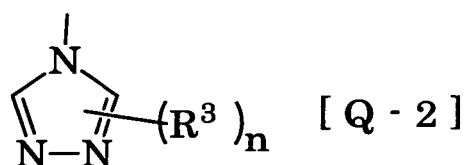
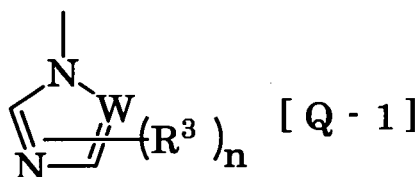
R^1 代表 $C_1\sim C_{10}$ 烷基、 $C_2\sim C_6$ 烯基、 $C_2\sim C_6$ 炔基、 $C_3\sim C_6$ 環烷
基、 $C_3\sim C_6$ 環烷基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵烷基、 $C_2\sim C_6$ 鹵烯基、
 $C_1\sim C_6$ 烷硫基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 烷氧基 $C_1\sim C_6$ 烷基、 $C_1\sim C_6$ 鹵
烷氧基 $C_1\sim C_6$ 烷基、三($C_1\sim C_6$ 烷基)甲矽烷基 $C_1\sim C_6$ 烷基、氰
基 $C_1\sim C_6$ 烷基、gem-二($C_1\sim C_6$ 烷氧基) $C_1\sim C_6$ 烷基、羥基 $C_1\sim C_6$
烷基、胺基 $C_1\sim C_6$ 烷基（該烷基可經 R^{14} 或 R^{15} 取代）、可經選

自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基、可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基 $C_2 \sim C_6$ 烯基、可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯氧基 $C_1 \sim C_6$ 烷基、具有可相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中 1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環基(該碳數 1 至 9 之雜環基可經 1~5 個鹵素原子、 $C_1 \sim C_6$ 烷基、 $C_1 \sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基或氰基取代)或經具有可相同或相異之選自氧原子、硫原子及氮原子當中 1 至 5 個雜原子之碳數 1 至 9 之雜環取代之 $C_1 \sim C_6$ 烷基(該烷基可經 1~5 個鹵素原子、 $C_1 \sim C_6$ 烷基、 $C_1 \sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基、側氧基或氰基取代)，

前述雜環基含有氮原子時，可氧化成 N-氧化物，

R^2 為 $C_1 \sim C_6$ 烷基、 $C_2 \sim C_6$ 烯基、 $C_2 \sim C_6$ 炔基、 $C_3 \sim C_6$ 環烷基、 $C_1 \sim C_6$ 鹵烷基、 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基 $C_1 \sim C_6$ 烷基、或氰基 $C_1 \sim C_6$ 烷基，

Q 為以式 [Q-1] 或式 [Q-2] 表示之雜環基或鹵素原子，其中該鹵素原子不為溴，



式 [Q-1] 中，W 為氮原子或亞甲基，

式 [Q-1] 及式 [Q-2] 中， R^3 為巯基或 $C_1 \sim C_6$ 鹵烷基，

式 [Q-1] 及式 [Q-2] 中，n 為 0 或 1，

R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 及 R^{15} ，各自代表氫原子、 $C_1 \sim C_6$ 烷基、 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基、 $C_1 \sim C_6$ 烷基羰基、 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1 \sim C_6$ 鹵烷基、 $C_3 \sim C_6$ 環烷基 $C_1 \sim C_6$ 烷基、氰基 $C_1 \sim C_6$ 烷基

或可經選自取代基群 α 當中的取代基取代的苯基，

又， R^4 與 R^5 、 R^6 與 R^7 、 R^{12} 與 R^{13} 及 R^{14} 與 R^{15} ，可一體形成 $C_2 \sim C_7$ 伸烷基鏈，與鏈結之氮原子一起形成 3~8 員環，該伸烷基鏈可含有 1 個氧原子、硫原子或氮原子，

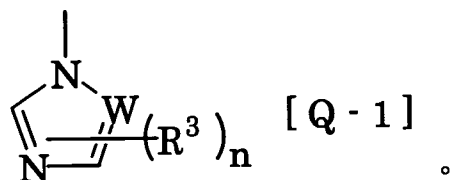
R^8 及 R^9 各自代表氫原子、 $C_1 \sim C_6$ 烷基或 $C_1 \sim C_6$ 烷氧基羰基，

R^{10} 為 $R^6 R^7 N$ 基或 Q ，

R^{11} 為 $C_1 \sim C_6$ 烷基。

3. 如申請專利範圍第 1 或 2 項所述之烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽，其中 Q 為鹵素原子，其中該鹵素原子不為溴。

4. 如申請專利範圍第 1 或 2 項所述之烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽，其中 Q 為式 [Q-1] 表示之雜環基



5. 一種有害生物防除劑，其特徵為含有如申請專利範圍第 1 至 4 項中任一項所述之烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽當做有效成分。

6. 如申請專利範圍第 5 項所述之有害生物防除劑，其係殺蟲劑。

7. 一種有害生物之防除方法，其特徵為使用有效分量之如申請專利範圍第 1 至 4 項中任一項所述之烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽。

8. 如申請專利範圍第 7 項所述之有害生物之防除方法，其係使用烷氧亞胺衍生物或其在農業上可容許之鹽當做殺蟲劑。