



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201418232 A

(43)公開日：中華民國 103 (2014) 年 05 月 16 日

(21)申請案號：102134206

(22)申請日：中華民國 102 (2013) 年 09 月 24 日

(51)Int. Cl.：

C07D261/04 (2006.01)

C07D261/08 (2006.01)

C07D413/12 (2006.01)

A01N43/80 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

A01P13/00 (2006.01)

(30)優先權：2012/09/25 歐洲專利局

12185767.6

(71)申請人：拜耳作物科學股份有限公司 (德國) BAYER CROPSCIENCE

AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

德國

(72)發明人：哈夫 克勞斯 HAAF, KLAUS BERNHARD (DE)；維爾姆斯 洛薩 WILLMS, LOTHAR (DE)；迪特李奇 漢斯耶爾格 DIETRICH, HANSJOERG (DE)；蓋茲維里爾 埃爾馬 GATZWEILER, ELMAR (DE)；羅辛格 克里斯多夫 ROSINGER, CHRISTOPHER HUGH (GB)；席姆茲勒 德克 SCHMUTZLER, DIRK (DE)；瓦亨多夫諾伊曼 烏若克 WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE (DE)；格羅斯讓考恩耶 瑪麗克萊爾 GROSJEAN-COURNOYER, MARIE-CLAIRE (FR)；拉雪茲海琳 LACHAISE, HELENE (FR)；里諾爾菲 菲力浦 RINOLFI, PHILIPPE (FR)；布呂內 斯蒂芬 BRUNET, STEPHANE (FR)

(74)代理人：林秋琴；陳彥希；何愛文

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：17 項 圖式數：0 共 147 頁

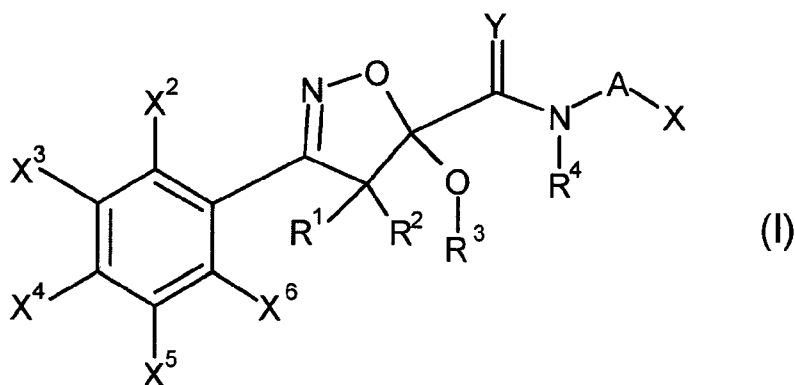
(54)名稱

具除草及殺真菌活性之 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類及 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-硫醯胺類

HERBICIDALLY AND FUNGICIDALLY ACTIVE 5-OXY-SUBSTITUTED 3-PHENYLISOXAZOLINE-5-CARBOXAMIDES AND 5-OXY-SUBSTITUTED 3-PHENYLISOXAZOLINE-5-THIOAMIDES

(57)摘要

本發明係說明一種如式(I)之具除草及殺真菌活性之 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類及 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-硫醯胺類



TW 201418232 A

此式(I)中，X、X²至X⁶、R¹至R⁴為如：氫、鹵素之基團，及如經取代之烷基之有機基團。A係一個鍵結或一個二價單位。Y係硫族元素。



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201418232 A

(43)公開日：中華民國 103 (2014) 年 05 月 16 日

(21)申請案號：102134206

(22)申請日：中華民國 102 (2013) 年 09 月 24 日

(51)Int. Cl.：

C07D261/04 (2006.01)

C07D261/08 (2006.01)

C07D413/12 (2006.01)

A01N43/80 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

A01P13/00 (2006.01)

(30)優先權：2012/09/25 歐洲專利局

12185767.6

(71)申請人：拜耳作物科學股份有限公司 (德國) BAYER CROPSCIENCE

AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

德國

(72)發明人：哈夫 克勞斯 HAAF, KLAUS BERNHARD (DE)；維爾姆斯 洛薩 WILLMS, LOTHAR (DE)；迪特李奇 漢斯耶爾格 DIETRICH, HANSJOERG (DE)；蓋茲維里爾 埃爾馬 GATZWEILER, ELMAR (DE)；羅辛格 克里斯多夫 ROSINGER, CHRISTOPHER HUGH (GB)；席姆茲勒 德克 SCHMUTZLER, DIRK (DE)；瓦亨多夫諾伊曼 烏若克 WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE (DE)；格羅斯讓考恩耶 瑪麗克萊爾 GROSJEAN-COURNOYER, MARIE-CLAIRE (FR)；拉雪茲海琳 LACHAISE, HELENE (FR)；里諾爾菲 菲力浦 RINOLFI, PHILIPPE (FR)；布呂內 斯蒂芬 BRUNET, STEPHANE (FR)

(74)代理人：林秋琴；陳彥希；何愛文

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：17 項 圖式數：0 共 147 頁

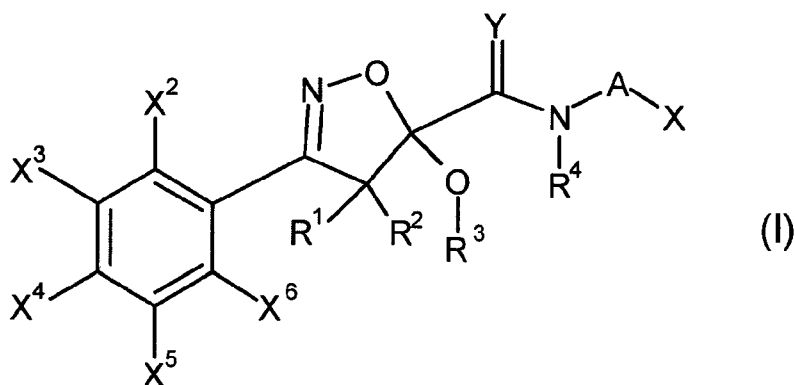
(54)名稱

具除草及殺真菌活性之 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類及 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-硫醯胺類

HERBICIDALLY AND FUNGICIDALLY ACTIVE 5-OXY-SUBSTITUTED 3-PHENYLISOXAZOLINE-5-CARBOXAMIDES AND 5-OXY-SUBSTITUTED 3-PHENYLISOXAZOLINE-5-THIOAMIDES

(57)摘要

本發明係說明一種如式(I)之具除草及殺真菌活性之 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類及 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-硫醯胺類



發明摘要

※ 申請案號：102134206

※ 申請日：102.9.24

※IPC 分類：C07D413/12 (2006.01)

C07D261/04 (2006.01)

C07D261/08 (2006.01)

A01N43/80 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

A01P 13/00 (2006.01)

【發明名稱】 (中文/英文)

具除草及殺真菌活性之 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類及 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-硫醯胺類

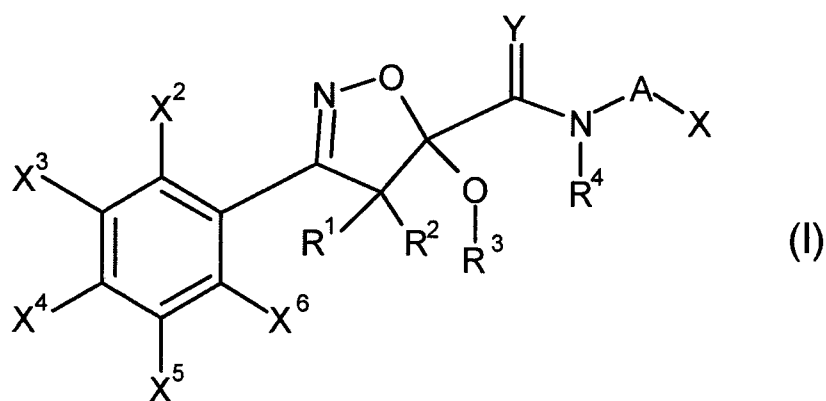
HERBICIDALLY AND FUNGICIDALLY ACTIVE 5-OXY-SUBSTITUTED

3-PHENYLISOXAZOLINE-5-CARBOXAMIDES AND

5-OXY-SUBSTITUTED 3-PHENYLISOXAZOLINE-5-THIOAMIDES

【中文】

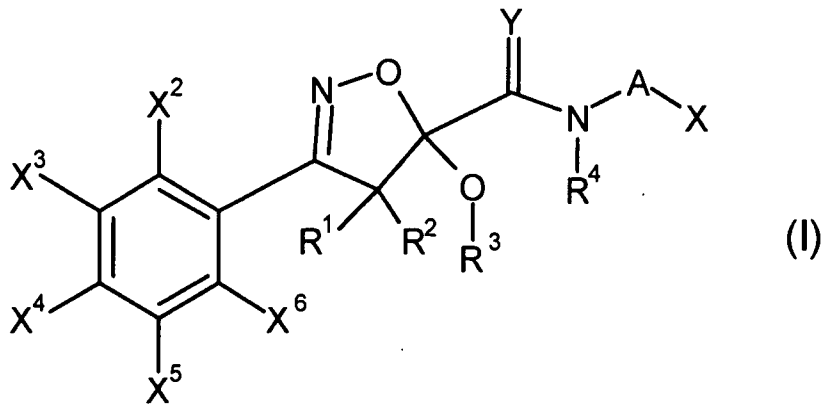
本發明係說明一種如式(I)之具除草及殺真菌活性之 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類及 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-硫醯胺類



此式(I)中，X、X²至 X⁶、R¹至 R⁴為如：氫、鹵素之基團，及如經取代之烷基之有機基團。A 係一個鍵結或一個二價單位。Y 係硫族元素。

【英文】

Herbicidally and fungicidally active 5-oxy-substituted 3-phenylisoxazoline-5-carboxamides and 5-oxy-substituted 3-phenylisoxazoline-5-thioamides of the formula (I) are described.



In this formula (I), X, X² to X⁶, R¹ to R⁴ are radicals such as hydrogen, halogen and organic radicals such as substituted alkyl. A is a bond or a divalent unit. Y is a chalcogen.

【代表圖】

【本案指定代表圖】：無

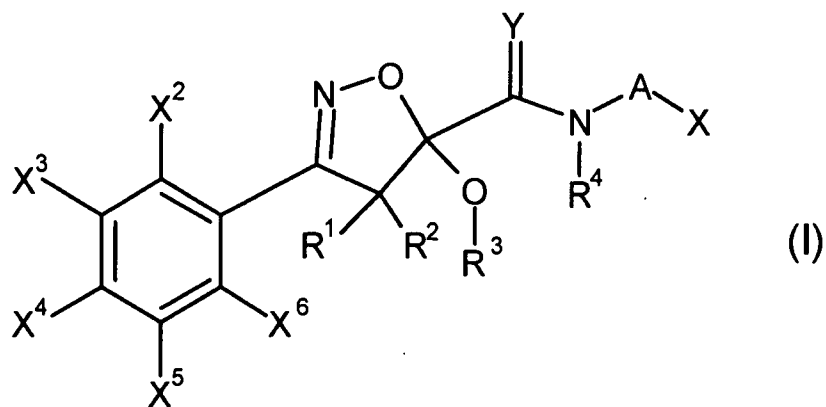
【本代表圖之符號簡單說明】：無

【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】：

無

【英文】

Herbicidally and fungicidally active 5-oxy-substituted 3-phenylisoxazoline-5-carboxamides and 5-oxy-substituted 3-phenylisoxazoline-5-thioamides of the formula (I) are described.



In this formula (I), X, X² to X⁶, R¹ to R⁴ are radicals such as hydrogen, halogen and organic radicals such as substituted alkyl. A is a bond or a divalent unit. Y is a chalcogen.

【代表圖】

【本案指定代表圖】：無

【本代表圖之符號簡單說明】：無

【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】：

無

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

【發明名稱】(中文/英文)

具除草及殺真菌活性之 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類及 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-硫醯胺類

HERBICIDALLY AND FUNGICIDALLY ACTIVE 5-OXY-SUBSTITUTED
3-PHENYLISOXAZOLINE-5-CARBOXAMIDES AND
5-OXY-SUBSTITUTED 3-PHENYLISOXAZOLINE-5-THIOAMIDES

【技術領域】

本發明係有關除草劑與殺真菌劑之技術領域，尤指用於選擇性控制有用作物中之闊葉雜草及禾本科雜草之除草劑。

明確言之，其係有關一種經取代之 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類及 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-硫醯胺類，其製法及其於作為除草劑及殺真菌劑上之用途。

【先前技術】

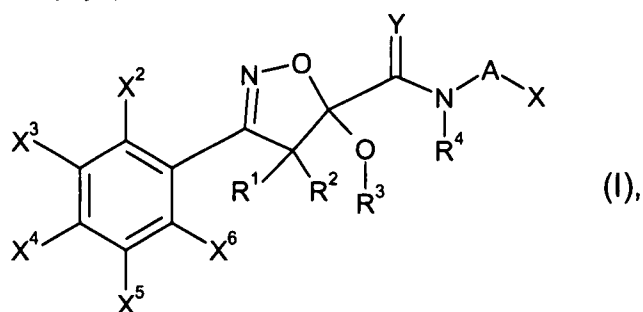
DE 4026018 A1、EP 0 520 371 A2 及 DE 4017665 揭示一種 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類，其在異噁唑啉環之 5 位置上帶有氫原子。該等文獻中說明此等化合物為農化活性安全劑，亦即可以消除除草劑在作物上之不需要之除草作用之化合物。其中未揭示此等化合物之除草作用。歐洲專利案申請案號 10170238(其具有更早之優先權日期，但在本申請案之優先權日期之前仍未公開)揭示一種具除草及殺真菌活性之 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類及 3-苯基異噁唑啉-5-硫醯胺類，其在異噁唑啉環之 5 位置上帶有氫原子。

Monatshefte Chemie (2010) 141, 461 及 Letters in Organic Chemistry (2010), 7, 502 亦揭示一種 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類，其在異噁唑啉環之 5 位置上帶有氫原子。其中揭示有些述及之化合物之殺真菌作用。

【發明內容】

本發明之目的係提供一種具除草及殺真菌活性之化合物。

已發現，5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類及 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-硫醯胺類特別適用為除草劑及殺真菌劑。本發明提供如式(I)之 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類及 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-硫醯胺類，或其鹽類，



其中

R^1 及 R^2 分別獨立為氫、氟、氯、溴、碘、氰基，或 (C_1-C_4) -烷基或 (C_1-C_4) -烷氧基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘及氰基，

或

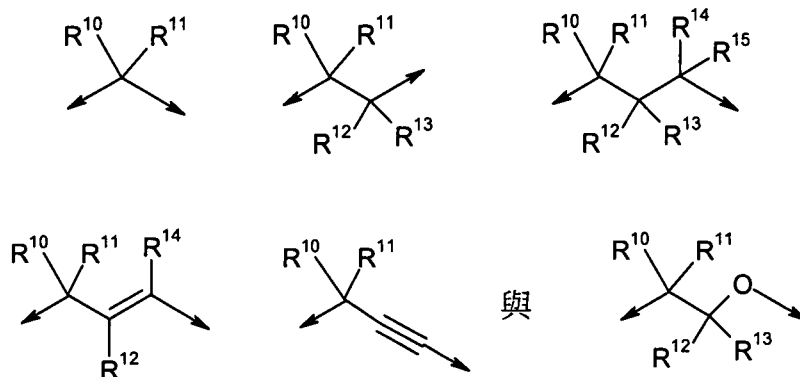
R^1 及 R^2 與其所鍵結之碳原子共同形成由 q 個碳原子及 p 個氧原子形成之飽和或部份或完全不飽和 3-、4-或 5-員環；

R^3 為 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -環烷基、 (C_2-C_6) -烯基或 (C_2-C_6) -炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基、 (C_1-C_4) -烷氧基及羥基，

R^4 為氫、氰基，

或(C₁-C₈)-烷基、(C₃-C₈)-環烷基、(C₃-C₈)-烯基或(C₃-C₈)-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基、羥基及(C₁-C₆)-烷氧基，

A 為一個鍵結或一個選自下列所組成群中之二價單位：



R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴ 及 R¹⁵ 分別獨立為氫、氟、氯、溴、碘、羥基、氰基、CO₂R⁸、CONR⁶R⁸、R⁵，

或(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₅)-環烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、羥基及氰基、

或(C₁-C₆)-烷氧基、(C₃-C₆)-環烷氧基、(C₂-C₆)-烯基氧或(C₂-C₆)-炔基氧，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及(C₁-C₂)-烷氧基；

Y 為氧或硫；

X 為氫、氰基、羥基、X¹，

或

(C₁-C₁₂)-烷基、(C₃-C₈)-環烷基、(C₂-C₁₂)-烯基或(C₂-C₁₂)-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基、羥基、OR⁷、X¹、OX¹、NHX¹、S(O)_nR⁵、SO₂NR⁶R⁷、SO₂NR⁶COR⁸、CO₂R⁸、CONR⁶R⁸、COR⁶、CONR⁸SO₂R⁵、NR⁶R⁸、NR⁶COR⁸、NR⁶CONR⁸R⁸、NR⁶CO₂R⁸、NR⁶SO₂R⁸、NR⁶SO₂NR⁶R⁸、OCONR⁶R⁸、OCSNR⁶R⁸、POR⁹R⁹ 及 C(R⁶)=NOR⁸，

或

X 、 A 及 R^4 與其所鍵結之氮原子共同形成飽和或部份或完全不飽和 5-、6- 或 7-員環，其包含此氮原子及 k 個碳原子、 n 個氧原子、 p 個硫原子及 p 個選自 NR^7 及 $NCOR^7$ 所組成群中之元素作為環原子，其中一個碳原子帶有 p 個側氧基；

X^1 為由 r 個碳原子、 s 個氮原子、 n 個硫原子及 n 個氧原子形成之 3-、4-、5-或 6-員飽和、部份飽和、完全不飽和或芳香環，其係經 s 個選自下列所組成群中之基團取代： R^6 、 R^{6a} 、 R^8 及 R^9 ，其中該硫原子及碳原子帶有 n 個側氧基；

或 X^1 為經 m 個選自 R^6 、 R^{6a} 、 R^8 及 R^9 所組成群中之基團取代之苯基；

X^2 、 X^4 及 X^6 分別獨立為氫、氟、氯、溴、碘、氰基、硝基，

或 (C_1-C_4) -烷基、 (C_3-C_5) -環烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_2-C_4) -烯基氧、 (C_2-C_4) -炔基氧或 (C_1-C_4) -烷基羰基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及 (C_1-C_4) -烷氧基；

X^3 及 X^5 分別獨立為氫、氟、氯、溴、碘、羥基、氰基、硝基、 SF_5 、 $CONR^8SO_2R^5$ 、 $CONR^6R^8$ 、 COR^6 、 CO_2R^8 、 $CONR^6R^8$ 、 $C(R^6)=NOR^8$ 、 NR^6COR^8 、 $NR^6CONR^8R^8$ 、 $NR^6CO_2R^8$ 、 $NR^6SO_2R^8$ 、 $NR^6SO_2NR^6R^8$ 、 $OCONR^6R^8$ 、 OSO_2R^5 、 $S(O)_nR^5$ 、 $SO_2NR^6R^8$ 、 $OSO_2NR^6R^8$ ，

或 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_5) -環烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、羥基及氰基，

或 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_3-C_6) -環烷氧基、 (C_2-C_6) -烯基氧或 (C_2-C_6) -炔基氧，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及 (C_1-C_2) -烷氧基；

R^5 為 (C_1-C_6) -烷基或 (C_3-C_6) -環烷基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及羥基；

R^6 為氫或 R^5 ；

R^{6a} 為氟、氯、溴、碘、氰基、羥基、 $S(O)_nR^5$ 、或 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_3-C_6) -烯基氧或 (C_3-C_6) -炔基氧，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：

氟、氯、溴、氰基及 (C_1-C_2) -烷氧基；

R^7 為氫或 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_6) -環烷基、 (C_2-C_4) -烯基或 (C_2-C_4) -炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、氰基及 (C_1-C_2) -烷氧基；

R^8 為 R^7 ，

R^9 為 (C_1-C_3) -烷基或 (C_1-C_3) -烷氧基；

k 為 3、4、5 或 6；

m 為 0、1、2、3、4 或 5；

n 為 0、1 或 2；

p 為 0 或 1；

q 為 3、4 或 5；

r 為 1、2、3、4 或 5；

s 為 0、1、2、3 或 4。

烷基意指具有分別指定碳原子數之飽和直鏈或分支之烴基，例如：

C_1-C_6 -烷基，如：甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基及 1-乙基-2-甲基丙基。

經鹵素取代之烷基意指直鏈或分支之烷基中有些或所有氫原子可能被鹵原子置換，例如： C_1-C_2 -鹵烷基，如：氯甲基、溴甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲

基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基及 1,1,1-三氟丙-2-基。

烯基意指具有分別指定碳原子數及一個可在任何位置之雙鍵之不飽和直鏈或分支之烴基，例如： C_2 - C_6 -烯基，如：乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、3,3-二甲基-2-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基及 1-乙基-2-甲基-2-丙烯基。

炔基意指具有分別指定碳原子數及一個在任何位置上之參鍵之直鏈或分支之烴基，例如： C_2 - C_6 -炔基，如：乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基(或炔丙基)、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、1-戊炔基、2-戊炔

基、3-戊炔基、4-戊炔基、3-甲基-1-丁炔基、1-甲基-2-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、3-甲基-1-戊炔基、4-甲基-1-戊炔基、1-甲基-2-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基及 1-乙基-1-甲基-2-丙炔基。

烷氧基意指具有分別指定碳原子數之飽和直鏈或分支之烷氧基，例如： C_1 - C_6 -烷氧基，如：甲氧基、乙氧基、丙氧基、1-甲基乙氧基、丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基、1,1-二甲基乙氧基、戊氧基、1-甲基丁氧基、2-甲基丁氧基、3-甲基丁氧基、2,2-二甲基丙氧基、1-乙基丙氧基、己氧基、1,1-二甲基丙氧基、1,2-二甲基丙氧基、1-甲基戊氧基、2-甲基戊氧基、3-甲基戊氧基、4-甲基戊氧基、1,1-二甲基丁氧基、1,2-二甲基丁氧基、1,3-二甲基丁氧基、2,2-二甲基丁氧基、2,3-二甲基丁氧基、3,3-二甲基丁氧基、1-乙基丁氧基、2-乙基丁氧基、1,1,2-三甲基丙氧基、1,2,2-三甲基丙氧基、1-乙基-1-甲基丙氧基及 1-乙基-2-甲基丙氧基。經鹵素取代之烷氧基意指具有分別指定碳原子數之直鏈或分支之烷氧基中部份或所有氫被上述鹵原子置換，例如： C_1 - C_2 -鹵烷氧基，如：氯甲氧基、溴甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、1-氯乙氧基、1-溴乙氧基、1-氟乙氧基、2-氟乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-1,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基及 1,1,1-三氟丙-2-氧基。

依據取代基之性質及其所附接之方式而定，式(I)化合物可能出現立體異構物。若例如：存在一個或多個不對稱取代之碳原子與/或亞砷時，其可

能出現對映異構物及非對映異構物。可採用習知分離法，例如：層析分離法，從製法所得之混合物中得到立體異構物。亦可能採用光學活性起始物及/或輔劑進行立體選擇性反應，選擇性製備立體異構物。本發明亦有關涵括在式(I)中，但未明確定義之所有立體異構物，及其混合物。然而為了簡便，儘管下文中僅提及式(I)化合物，但其可能意指該純化合物及若適當時亦指具有不同異構化合物比例之混合物。

根據如上述定義之取代基性質，式(I)化合物具有酸性性質，可以形成鹽類，若適當時，亦可與無機或有機鹼類或與金屬離子形成內鹽或加合物。若式(I)化合物帶有羥基、羧基或其他可誘發酸性性質之基團時，此等化合物可與鹼類反應形成鹽。合適鹼類為例如：鹼金屬與鹼土金屬之氫氧化物、碳酸鹽類、碳酸氫鹽類，尤指鈉、鉀、鎂、與鈣，及氨、具有 C₁-C₄-烷基之一級、二級及三級胺、C₁-C₄-烷醇之單-、二-及三烷醇胺、膽鹼與氯膽鹼等之鹽類。

若一個基團被基團多取代時，其意指此基團被一個或多個相同或不同之如上述基團取代。

下文出示之所有化學式中，取代基及代號均如式(I)中之定義，除非另有不同定義。化學式中箭頭代表其與其餘分子之附接點。

較佳係式(I)之 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類及 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-硫醯胺類，其中

R¹ 及 R² 分別獨立為氫、氟、氯、溴、碘、氰基，或(C₁-C₄)-烷基或(C₁-C₄)-烷氧基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘及氰基，

或

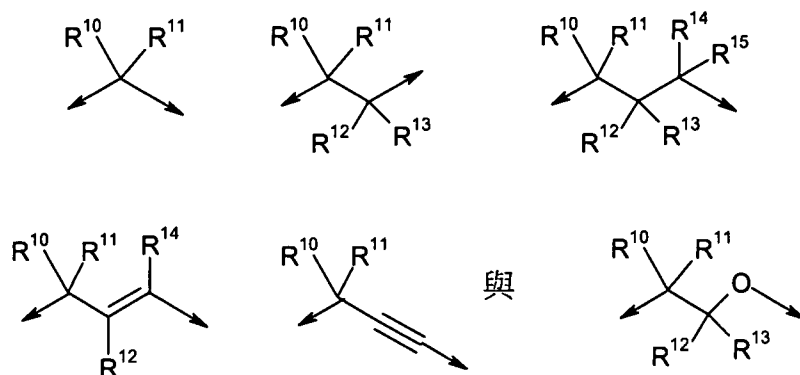
R¹ 及 R² 與其所鍵結之碳原子共同形成由 q 個碳原子及 p 個氧原子形成之飽和或部份或完全不飽和 3-、4-或 5-員環；

R^3 為(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-環烷基、(C₂-C₆)-烯基或(C₂-C₆)-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基、(C₁-C₄)-烷氧基及羥基，

R^4 為氫、氰基，

或(C₁-C₈)-烷基或(C₃-C₈)-環烷基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基、羥基及(C₁-C₆)-烷氧基；

A 為一個鍵結或一個選自下列所組成群中之二價單位：



R^{10} 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 及 R^{15} 分別獨立為

氫、氟、氯、溴、碘、羥基、氰基、 CO_2R^8 、 CONR^6R^8 、 R^5 ，

或(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₅)-環烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、羥基及氰基，

或(C₁-C₆)-烷氧基、(C₃-C₆)-環烷氧基、(C₂-C₆)-烯基氧或(C₂-C₆)-炔基氧，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及(C₁-C₂)-烷氧基；

Y 為氧或硫；

X 為氫、氰基、羥基、 X^1 ，

或

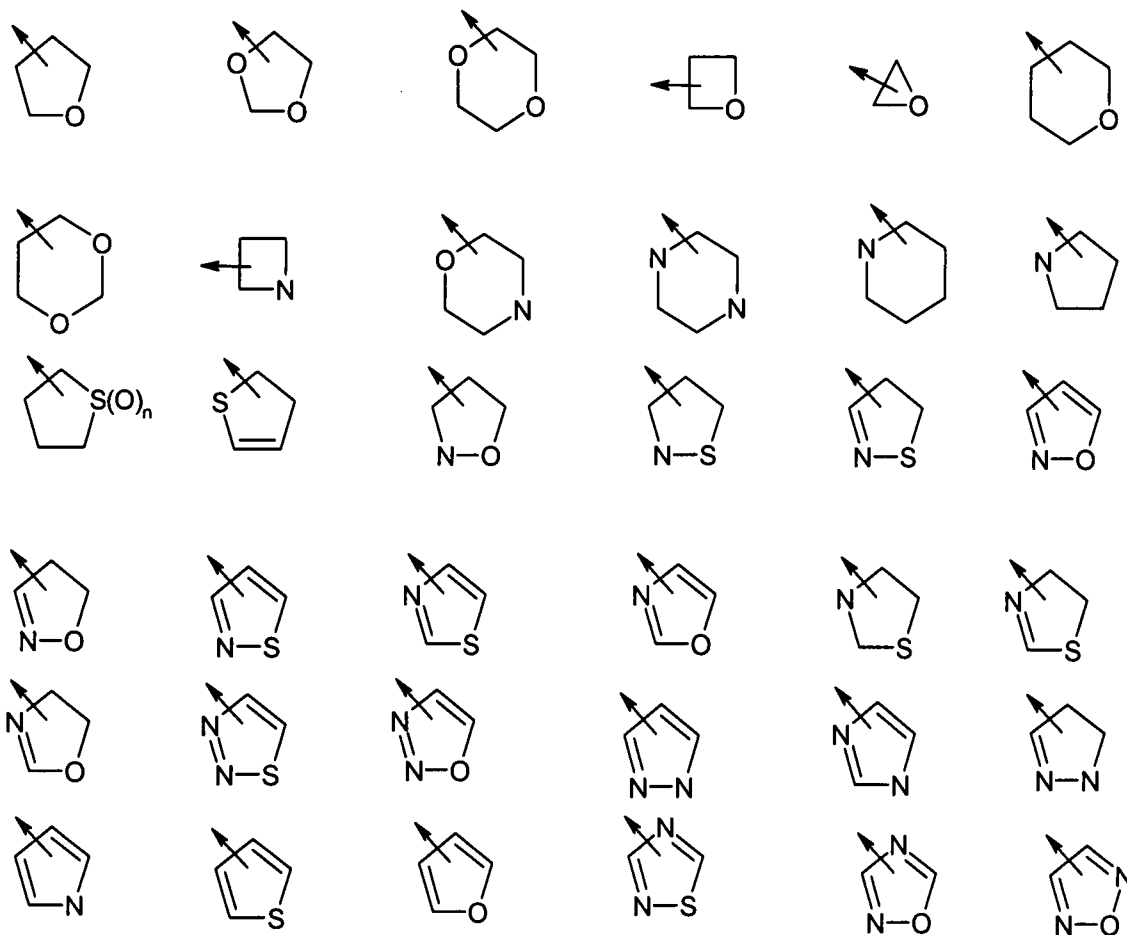
(C₁-C₁₂)-烷基、(C₃-C₈)-環烷基、(C₂-C₁₂)-烯基或(C₂-C₁₂)-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基、羥基、 OR^7 、 X^1 、 OX^1 、 NHX^1 、 S(O)_nR^5 、 $\text{SO}_2\text{NR}^6R^7$ 、 $\text{SO}_2\text{NR}^6\text{COR}^8$ 、 CO_2R^8 、 CONR^6R^8 、

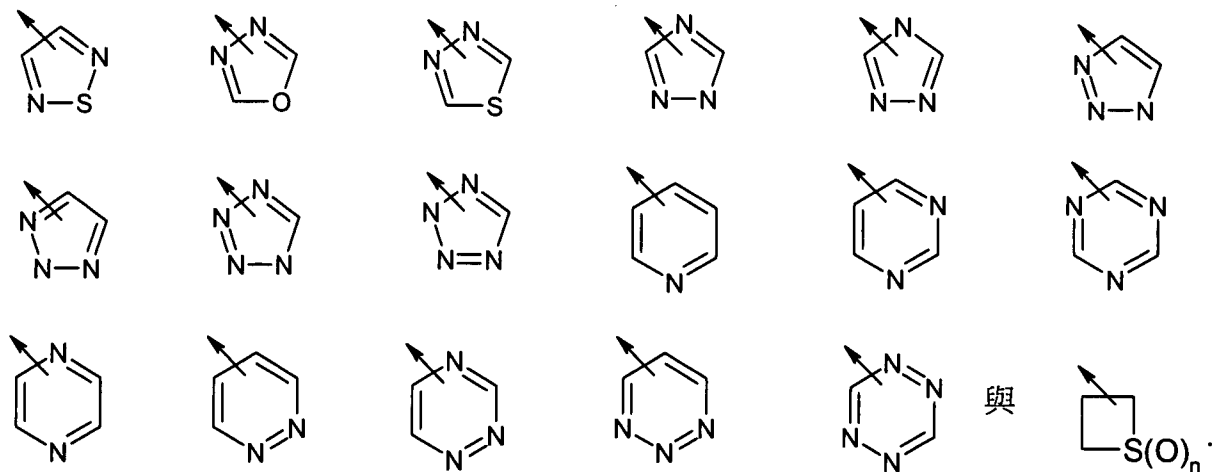
COR^6 、 $\text{CONR}^8\text{SO}_2\text{R}^5$ 、 NR^6R^8 、 NR^6COR^8 、 $\text{NR}^6\text{CONR}^8\text{R}^8$ 、 $\text{NR}^6\text{CO}_2\text{R}^8$ 、 $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{R}^8$ 、
 $\text{NR}^6\text{SO}_2\text{NR}^6\text{R}^8$ 、 OCONR^6R^8 、 OCSNR^6R^8 、 POR^9R^9 及 $\text{C}(\text{R}^6)=\text{NOR}^8$ ，

或

X、A 及 R^4 與其所鍵結之氮原子共同形成飽和或部份或完全不飽和 5-、6- 或 7-員環，其包含此氮原子、k 個碳原子、n 個氧原子、p 個硫原子及 p 個選自 NR^7 及 NCOR^7 所組成群中之元素作為環原子，其中一個碳原子帶有 p 個側氧基；

X^1 為一個環，其係經 s 個選自 R^6 、 R^{6a} 、 R^8 及 R^9 所組成群中之基團取代，且係選自下列所組成群中：





或 X^1 為經選自 R^6 、 R^{6a} 、 R^8 及 R^9 所組成群中之基團取代之苯基；

X^2 、 X^4 及 X^6 分別獨立為氫、氟、氯、溴、碘、氰基、硝基，

或 (C_1-C_4) -烷基、 (C_3-C_5) -環烷基、 (C_2-C_4) -烯基、 (C_2-C_4) -炔基、 (C_1-C_4) -烷氧基、 (C_2-C_4) -烯基氧、 (C_2-C_4) -炔基氧或 (C_1-C_4) -烷基羰基，其分別經 m 個選

自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及 (C_1-C_4) -烷氧基；

X^3 與 X^5 分別獨立為氫、氟、氯、溴、碘、羥基、氰基、硝基、 SF_5 、

$CONR^8SO_2R^5$ 、 $CONR^6R^8$ 、 COR^6 、 CO_2R^8 、 $CONR^6R^8$ 、 $C(R^6)=NOR^8$ 、 NR^6COR^8 、

$NR^6CONR^8R^8$ 、 $NR^6CO_2R^8$ 、 $NR^6SO_2R^8$ 、 $NR^6SO_2NR^6R^8$ 、 $OCONR^6R^8$ 、 OSO_2R^5 、

$S(O)_nR^5$ 、 $SO_2NR^6R^8$ 、 $OSO_2NR^6R^8$ ，

或 (C_1-C_6) -烷基、 (C_3-C_5) -環烷基、 (C_2-C_6) -烯基、 (C_2-C_6) -炔基，其分別經 m

個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、羥基及氰基，

或 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_3-C_6) -環烷氧基、 (C_2-C_6) -烯基氧或 (C_2-C_6) -炔基氧，其

分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及 (C_1-C_2) -

烷氧基；

R^5 為 (C_1-C_6) -烷基或 (C_3-C_6) -環烷基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之

基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及羥基；

R^6 為氫或 R^5 ；

R^{6a} 為氟、氯、溴、碘、氰基、羥基、 $S(O)_nR^5$ ，或 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_2-C_6) -

烯基氧或 (C_2-C_6) -炔基氧，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：

氟、氯、溴、氰基及(C₁-C₂)-烷氧基；

R⁷ 為氫或(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-環烷基、(C₂-C₄)-烯基或(C₂-C₄)-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、氰基及(C₁-C₂)-烷氧基；

R⁸ 為 R⁷，

R⁹ 為(C₁-C₃)-烷基或(C₁-C₃)-烷氧基；

k 為 3、4、5 或 6；

m 為 0、1、2、3、4 或 5；

n 為 0、1 或 2；

p 為 0 或 1；

q 為 3、4 或 5；

s 為 0、1、2、3 或 4。

特別佳為式(I)之 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類及 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-硫醯胺類，其中

R¹ 及 R² 分別獨立為氫、氟、氯、溴、碘、氰基，或經 m 個選自氟、氯、溴、碘及氰基所組成群中之基團取代之(C₁-C₄)-烷基；

R³ 為(C₁-C₄)-烷基、(C₃-C₄)-環烷基、(C₂-C₃)-烯基或(C₂-C₃)-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、氰基、(C₁-C₂)-烷氧基，

A 為一個鍵結或一個選自下列所組成群中之二價單位：CH₂、CH₂CH₂、CHCH₃、CH₂CH₂CH₂、CH(CH₂CH₃)、CH(CH₃)CH₂、C(CH₃)₂、C(CH₃)₂CH₂、C(iPr)CH₃、CH(CH₂iPr)CH₂、CH₂CH=CH、C(CH₃)₂C≡C、CH(CF₃)CH₂、CH(CH₃)CH₂O、CH₂CH₂O、CH(cPr)CH₂O、CH(CH₂OCH₃)、CH(CH₂CH₂SCH₃)、CH(COOH)、CH(COOCH₃)、CH(COOH)CH₂、CH(COOCH₃)CH₂、CH₂COH(CF₃)、CH(CONHCH₃)、CH(CONHCH₃)CH₂ 與 CH₂CH₂CONHCH₂；

R⁴ 為氫或 (C₁-C₈)-烷基；

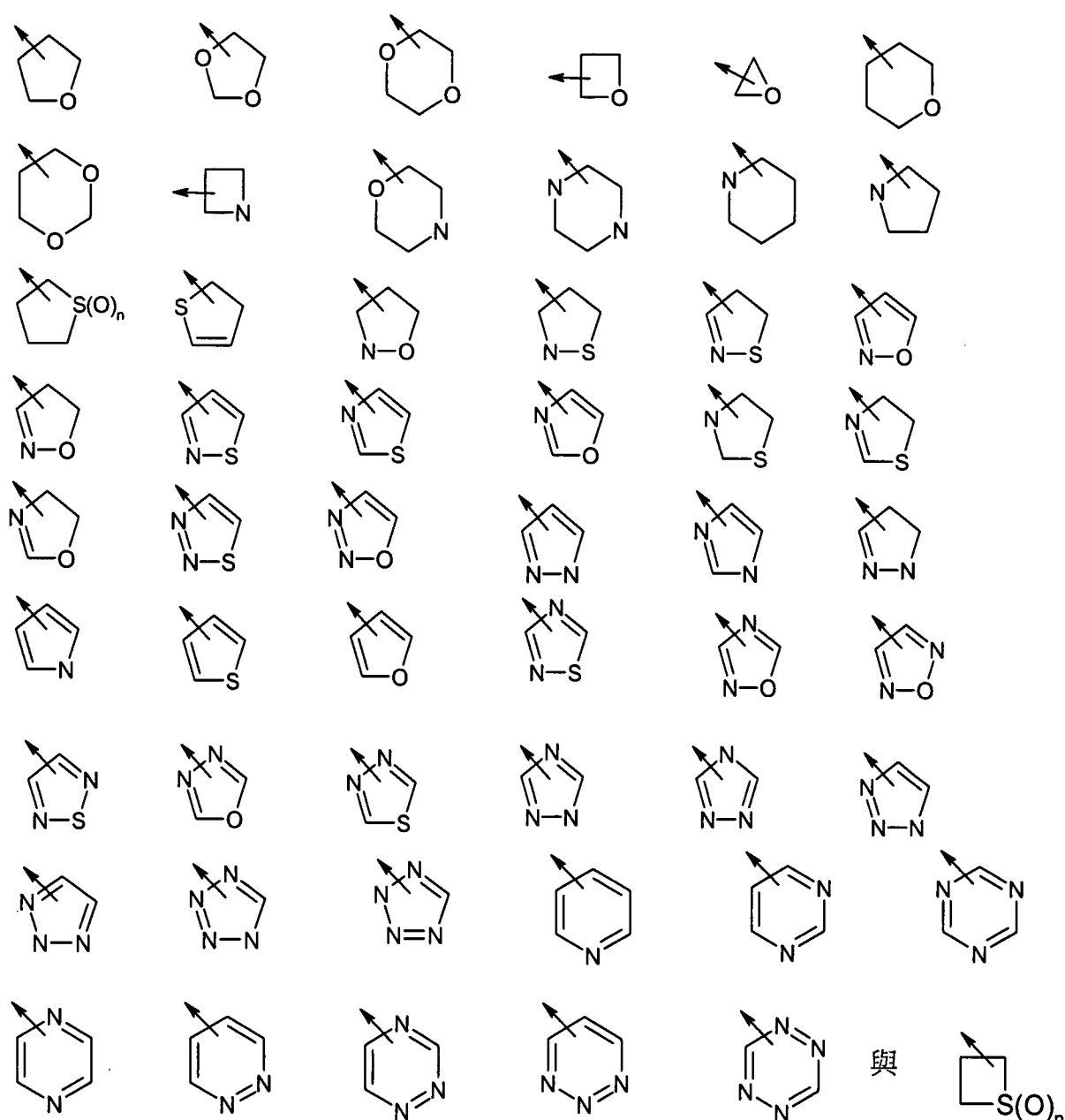
Y 為氧或硫；

X 為氫、氟基、羥基、 X^1 ，

或

(C_1 - C_{12})-烷基、(C_3 - C_8)-環烷基、(C_2 - C_{12})-烯基或(C_2 - C_{12})-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、氟基、羥基、 OR^7 、 X^1 、 OX^1 、 NHX^1 、 $S(O)_nR^5$ 、 CO_2R^8 、 $CONR^6R^8$ 、 $CONR^8SO_2R^5$ 及 POR^9R^9 ；

X^1 為一個環，其係經 s 個選自 R^6 、 R^{6a} 、 R^8 及 R^9 所組成群中之基團取代，且係選自下列所組成群中：



或 X^1 為經 m 個選自 R^6 、 R^{6a} 、 R^8 及 R^9 所組成群中之基團取代之苯基；

X^2 、 X^4 及 X^6 分別獨立為氫、氟、或氯，

或 (C_1-C_4) -烷基或 (C_1-C_4) -烷氧基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、氰基及 (C_1-C_4) -烷氧基；

X^3 及 X^5 分別獨立為氫、氟、氯、溴、氰基，

或經 m 個選自氟及氯所組成群中之基團取代之 (C_1-C_6) -烷基，

或經 m 個選自氟及氯所組成群中之基團取代之 (C_1-C_6) -烷氧基；

R^5 為甲基或乙基；

R^6 為氫或 R^5 ；

R^{6a} 為氟、氯、溴、碘、氰基、羥基、 $S(O)_nR^5$ ，或 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_2-C_6) -烯基氧或 (C_2-C_6) -炔基氧，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：

氟、氯、溴、氰基及 (C_1-C_2) -烷氧基；

R^7 為氫或經 m 個選自氟及氯所組成群中之基團取代之 (C_1-C_6) -烷基；

R^8 為 R^7 ，

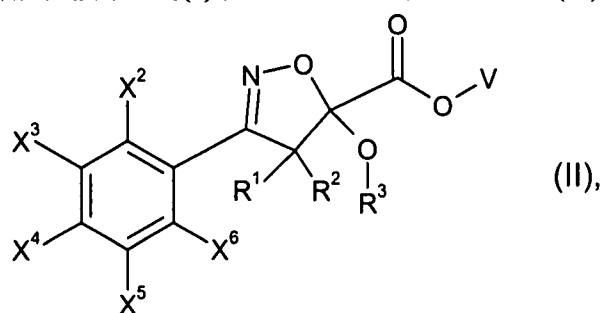
R^9 為 (C_1-C_3) -烷氧基；

m 為 0、1、2 或 3；

n 為 0、1 或 2；

s 為 0、1、2、3 或 4。

適合製備本發明式(I)化合物之中間物為式(II)化合物：

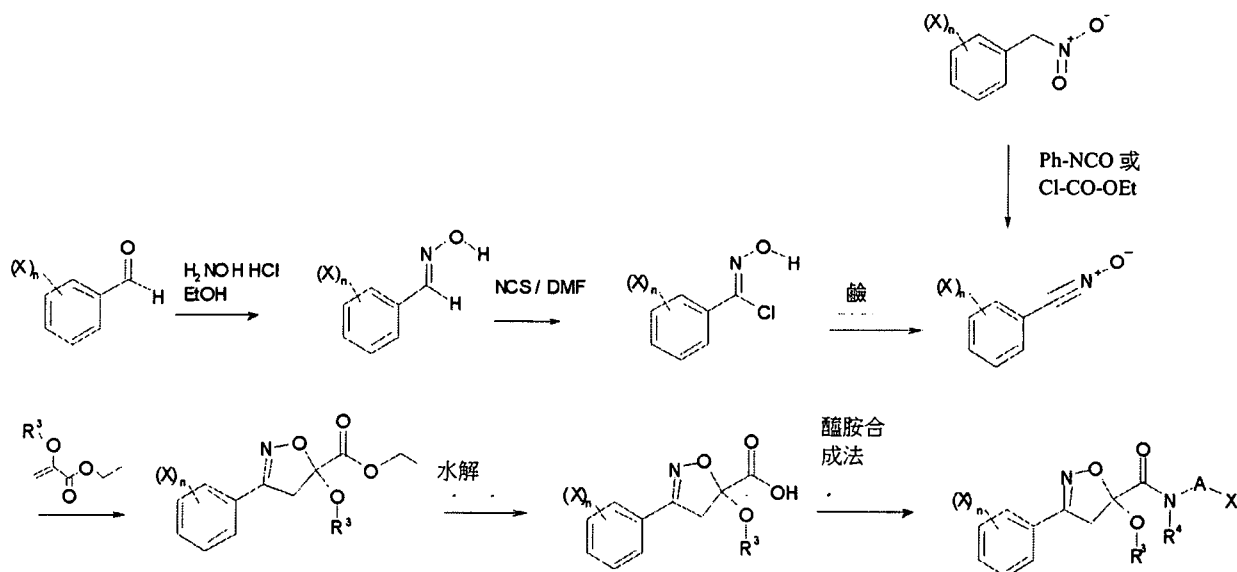


其中 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^5 基團分別如式(I)中說明

之定義，V 為氫或 R⁵。式(II)化合物為新穎化合物且同樣形成本發明主題之一部份。

本發明化合物可採用熟悉此相關技術者本身已知之反應製備，例如：根據反應圖 1 說明之反應順序。

反應圖 1

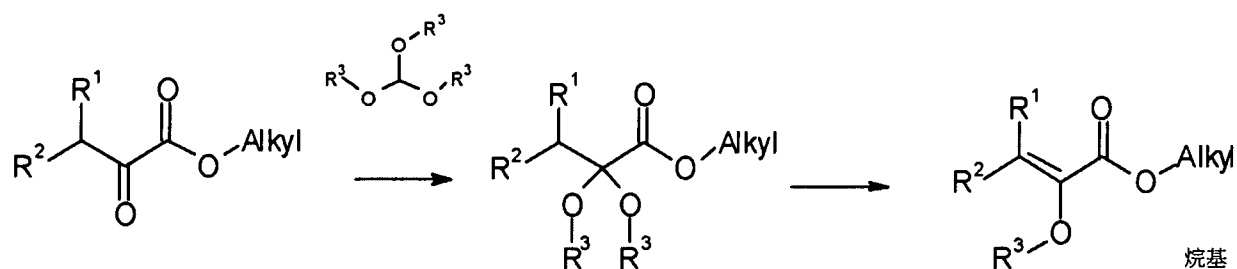


反應圖 1 及接續之反應圖中，(X)_n代表取代基 X²、X³、X⁴、X⁵及 X⁶。此等腈氧化物與合適親雙極試劑之 1,3-雙極性環加成反應說明於例如：文獻：1,3 雙極環加成化學(1,3 Dipolar Cycloaddition Chemistry), Padwa 編輯, Wiley, New York, 1984；Kanemasa 及 Tsuge 之 Heterocycles 1990, 30, 719。氮肟之製法參見 Kim, Jae N., Ryu, Eung K.之 J. Org. Chem. 1992, 57, 6649)。

在異噁唑啉環系之 4 及 5 位置經取代之本發明化合物同樣可經由 1,3-雙極性環加成反應，使用合適之 1,2-二取代之烯烴作為親雙極試劑製備。通常，此反應產生非對映異構物混合物，其可採用管柱層析法分離。光學活性異噁唑啉製法可由合適之前體或終產物進行對掌性 HPLC 製得，且同樣可經由對映異構性選擇性反應，例如：酵素性裂解酯或醯胺，或利用於親雙極試劑上之對掌性輔劑，如 Olssen (J. Org. Chem. 1988, 53, 2468)之說明。

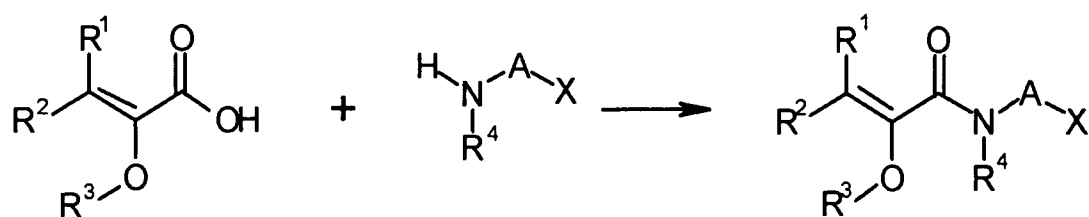
經適當取代之 2-烷氧基丙烯酸酯之製法(反應圖 2)可為例如：轉化 α -酮基酯形成相應縮酮(文獻：Wenkert, E；Alonso, M.E；Buckwalter B.L., Sanchez E.L. J. Am. Chem. Soc. 1983, 105, 2021 及文獻：LaMattina, J.L.；Mularski, C.J., J. Org. Chem. 1984, 49, 4800)，經過消除後，產生 2-烷氧基丙烯酸酯(類似文獻：Esswein A.等人之 Helvetica Chimica Acta 1989, 72(2), 213)。

反應圖 2



本發明化合物之製法中，亦可能使用經適當取代之 2-烷氧基丙烯酸醯胺(反應圖 3)。其可依反應圖 2 所述，由丙烯酸酯經過水解及醯胺形成法後製得。

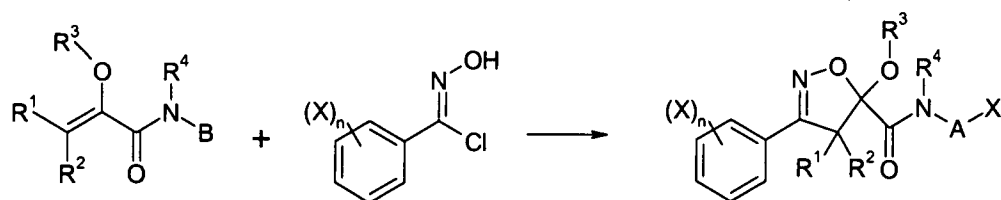
反應圖 3：



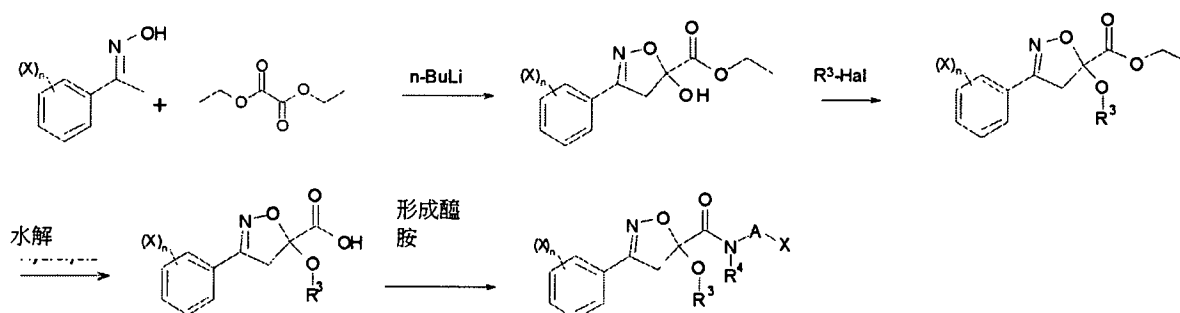
烷氧基丙烯酸之活化法可選用例如：碳化二亞胺，如：EDCI(Chen, F. M. F.；Benoiton, N. L. Synthesis 1979, 709)。製備丙烯酸醯胺時，可參見 US2521902、JP60112746·J. of Polymer Science 1979, 17 (6), 1655。於 1,3-環加成反應中，由經適當取代之 2-烷氧基丙烯酸醯胺經過脲氧化物轉化成本發明化合物(反應

圖 4)。

反應圖 4：

可在烯階段或在異噁唑啉階段轉化官能基 R^3 。反應圖 5 說明形成各種不同 R^3 -取代之異噁唑啉之途徑。

反應圖 5



草酸二酯與肟類之反應(反應圖 5)產生 5-羥基-3-苯基異噁唑啉(文獻：Dang, T.T., Albrecht U., Langer P., *Synthesis* 2006, 15, 2515)。然後在適合條件下衍化羥基。由酯水解及接著形成醯胺後，得到目標化合物。

反應圖 6 說明 5-烷氧基-3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺類使用勞森試劑(Lawesson reagent)轉化成 5-烷氧基-3-苯基異噁唑啉-5-硫醯胺類之途徑(文獻：WYETH, WO2003/93277, 文獻：Wishka D.G., Walker D.P., *Tetrahedron Letters* 2011, 52, 4713-4715)。

反應圖 6

勞森試劑



可根據上述反應合成之式(I)化合物及/或其鹽類之集合亦可依平行方式製備，其可採用手動方式、部份自動化或完全自動化方式進行。此時，可能例如：使反應製程、操作法或產物或中間物之純化法自動化。總言之，此製程可從例如：D. Tiebes 於”組合化學-合成法、分析法、篩選法 (Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening)(Günther Jung 編輯)，Wiley 1999，第 1 至 34 頁”中之說明了解。

商業上有許多設備可用於平行進行反應製程及操作，例如：卡氏反應槽(Calpyso reaction blocks)(來自 Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, USA)，或反應站(來自 Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 11 3AZ，英國)或多探針自動化工作站(MultiPROBE Automated Workstations)(來自 Perkin Elmar, Waltham, Massachusetts 02451, USA)。平行進行製備過程中所產生式(I)化合物及其鹽類或中間物之純化法可採用之設備包括層析設備(例如：來自 ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA)。

上列進行模組化製程之設備中，每一輪程序係自動化進行，但每輪工作程序之間必需手動操作。此作法即不需要利用藉由例如：自動化工具操作之各自動模組之部份或完全集成自動化系統。此等自動化系統可得自例如：Caliper, Hopkinton, MA 01748, USA。

個別或數個合成步驟可藉助於利用以聚合物為擔體之試劑/清除劑樹脂執行。該專業文獻說明一系列實驗程序，例如：ChemFiles, Vol. 4, 編號 1, “溶液相合成法之以聚合物為擔體之清除劑與樹脂 (Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis)(Sigma-Aldrich)。

除了本文說明之方法外，式(I)化合物及其鹽類之製法可完全或部份採

用固相擔體方法進行。基於此目的，讓合成法或配合相關製程之合成法之個別中間物或所有中間物結合在合成樹脂上。固相擔體合成法已詳細說明於專業文獻中，例如：Barry A. Bunin 之“組合指數(The Combinatorial Index)”，Academic Press, 1998 及”組合化學-合成法、分析法、篩選法(Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening)(Günther Jung 編輯)，Wiley 1999”。利用固相擔體合成法可以進行一系列文獻中已知之方法，其同樣可依手動或自動化方式進行。例如：該反應可利用 IRORI 技術，於來自 Nexus Biosystems, 12140 Community Road, Poway, CA92064, USA 之微反應器中進行。

於固相及液相中進行之個別或數個合成步驟可藉助於微波技術進行。一系列實驗法已說明於專業文獻中，例如：“有機與醫學化學之微波法(Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry) (C. O. Kappe 及 A. Stadler 編輯)，Wiley, 2005”。

根據本文所說明製法可製備呈集成物質型式之式(I)化合物及其鹽類，其稱為集合庫。本發明亦提出一種包含至少兩種式(I)化合物及其鹽類之集合庫。

根據本發明式(I)化合物(及/或其鹽類)(下文中統稱為"本發明化合物")具有優異除草效力，可對抗影響經濟重要性之廣譜單子葉與雙子葉一年生有害植物。該等活性成份亦可有效對抗會從根莖、初生主根或其他多年生器官長出幼芽而且很難控制之多年生有害植物。

本發明因此亦提出一種控制不要之植物或調節植物生長(較佳係作物)之方法，其中施用一或多種本發明化合物(群)至植物(例如：有害植物，如：單子葉或雙子葉雜草或不需要之作物植株)、種子(例如：穀粒、種子或營養性繁殖株如：塊莖或帶芽之幼枝)或有植物生長之區域(例如：栽種區域)。本發明化合物可在例如：播種前(若適合時亦可混入土壤中)、出土前或出土後施用。可利用本發明化合物控制之單子葉與雙子葉雜草群之有些明確代

表性實例可述及下列(但無意限制某些特定品種)：

單子葉有害植物類屬：擬硬皮橘(*Aegilops*)、小麥草(*Agropyron*)、糠穗(*Agrostis*)、看麥娘(*Alopecurus*)、翦股穎(*Apera*)、烏麥(*Avena*)、臂形草(*Brachiaria*)、雀麥(*Bromus*)、疾藜菜(*Cenchrus*)、鴨拓草(*Commelina*)、狗牙根(*Cynodon*)、莎草(*Cyperus*)、指梳草(*Dactyloctenium*)、馬唐(*Digitaria*)、野稗(*Echinochloa*)、藺草(*Eleocharis*)、牛筋草(*Eleusine*)、畫眉草(*Eragrostis*)、鳴子稗(*Eriochloa*)、牧場草(*Festuca*)、飄拂草(*Fimbristylis*)、異藥花(*Heteranthera*)、白茅(*Imperata*)、鴨嘴草(*Ischaemum*)、畔茅(*Leptochloa*)、毒麥(*Lolium*)、雨久花(*Monochoria*)、稷(*Panicum*)、雀稗(*Paspalum*)、草蘆(*Phalaris*)、梯牧草(*Phleum*)、長齒草(*Poa*)、牛鞭草(*Rottboellia*)、慈姑(*Sagittaria*)、蓆草(*Scripus*)、莠草(*Setaria*)、高粱(*Sorghum*)。

雙子葉雜草類屬：苘麻(*Abutilon*)、莧(*Amaranthus*)、豚草(*Ambrosia*)、錦葵(*Anoda*)、羅馬加密列花(*Anthemis*)、糙葉樹(*Aphanes*)、茵陳蒿(*Artemisia*)、濱藜(*Atriplex*)、雛菊(*Bellis*)、鬼針草(*Bidens*)、薺菜(*Capsella*)、大薊(*Carduus*)、山扁豆(*Cassia*)、矢草菊(*Centaurea*)、藜(*Chenopodium*)、薊(*Cirsium*)、三色旋花(*Convolvulus*)、曼陀羅花(*Datura*)、跳舞草(*Desmodium*)、次酸模(*Emex*)、大橙黃草(*Erysimum*)、大戟(*Euphorbia*)、鼬瓣花(*Galeopsis*)、牛膝菊(*Galinsoga*)、豬殃殃(*Galium*)、木槿(*Hibiscus*)、甘藷(*Ipomoea*)、地膚(*Kochia*)、野芝麻(*Lamium*)、獨行菜(*Lepidium*)、陌上菜(*Lindernia*)、西洋甘菊(*Matricaria*)、薄荷(*Mentha*)、山藍(*Mercurialis*)、粟米草(*Mullugo*)、勿忘草(*Myosotis*)、罌粟(*Papaver*)、牽牛(*Pharbitis*)、車前草(*Plantago*)、蓼(*Polygonum*)、馬齒莧(*Portulaca*)、毛茛(*Ranunculus*)、蘿蔔(*Raphanus*)、焊菜(*Rorippa*)、節節草(*Rotala*)、酸模(*Rumex*)、豬毛菜(*Salsola*)、瓜葉菊(*Senecio*)、田菁(*Sesbania*)、午時花(*Sida*)、白芥(*Sinapis*)、茄(*Solanum*)、苦苣菜(*Sonchus*)、尖瓣花(*Sphenoclea*)、繁縷(*Stellaria*)、蒲公英(*Taraxacum*)、遏藍菜(*Thlaspi*)、三葉草(*Trifolium*)、蕁麻(*Urtica*)、玄參(*Veronica*)、堇菜(*Viola*)、苔耳

(Xanthium)。

若本發明化合物在萌芽前先施用在土壤表面上時，可以完全防止雜草幼苗出土或防止雜草生長直到其到達子葉階段為止，但隨後可阻止其生長，且最後經過 3 至 4 週後即完全死亡。

若在出土後施用活性成份至綠色植株上時，即在處理後停止生長，讓有害植物停留在施用時之生長階段，或在一段時間後完全死亡，因此可以在極早期並持續消除對作物植株不利之雜草競爭。

雖然本發明化合物對單子葉與雙子葉雜草展現優異之除草活性，但對經濟重要性之作物，例如：雙子葉作物類屬：花生(*Arachis*)、甜菜(*Beta*)、蕓苔(*Brassica*)、甜瓜(*Cucumis*)、南瓜(*Cucurbita*)、向日葵(*Helianthus*)、胡蘿蔔(*Daucus*)、大豆(*Glycine*)、草棉(*Gossypium*)、甘藷(*Ipomoea*)、萵苣(*Lactuca*)、亞麻(*Linum*)、番茄(*Lycopersicon*)、煙草(*Nicotiana*)、菜豆(*Phaseolus*)、豌豆(*Pisum*)、茄(*Solanum*)、蠶豆(*Vicia*)，或單子葉作物類屬：蔥(*Allium*)、鳳梨(*Ananas*)、蘆筍(*Asparagus*)、烏麥(*Avena*)、大麥(*Hordeum*)、稻(*Oryza*)、稷(*Panicum*)、甘蔗(*Saccharum*)、黑麥(*Secale*)、高粱(*Sorghum*)、硬粒小麥(*Triticale*)、小麥(*Triticum*)、玉米(*Zea*)(尤指玉米(*Zea*)與小麥(*Triticum*))之傷害則僅達不顯著之程度，或完全沒有傷害，其係依本發明各化合物之結構及施用率而定。基於此等理由，本發明化合物極適用於選擇性控制作物(如：農業上有用作物或觀賞植物)中不要之植株生長。

此外，本發明化合物(依其各結構及施用率而定)對作物植株具有優異之生長調節性質。其可干預調節植物之代謝作用，因此可用於控制影響植物組成，及促進採收，例如：啟動脫水及阻止生長。此外，其亦適合一般控制及抑制不要之營養性生長，不會殺死植物。抑制營養性生長之作法在許多單子葉及雙子葉作物中扮演重要角色，因為例如：可藉以減少或完全預防倒伏。

基於其除草及調節植物生長性質，活性成份亦可用於已知基因改造作

物或仍待發展之植物中控制有害植物。通常，轉殖基因植物之特徵在於特別有利之性質，例如：對某些農藥(特定言之針對某些除草劑)之抗性、對植物病害或引起植物病害之生物體(如：某些昆蟲或微生物，如：真菌、細菌或病毒)之抗性。其他特殊性質係有關例如：採收材料之產量、品質、儲存性、組成物及特定組成份。例如：具有提高之澱粉含量或經改變之澱粉品質之轉殖基因植物或彼等具有不同脂肪酸組成物之採收材料之轉殖基因植物係已知者。其他特別性質在於對非生物性逆境壓因子(例如：熱、冷、乾旱、鹽度、及紫外線)之耐受性或抗性。

本發明式(I)化合物或其鹽類較佳係用在具經濟重要性之有用植物與觀賞植物之轉殖基因作物，例如：穀類，如：小麥、大麥、裸麥、燕麥、高粱、及小米、稻、樹薯與玉米，或甜菜、棉花、大豆、油菜、馬鈴薯、番茄、豌豆、及其他蔬菜等作物。

式(I)化合物較佳係作為除草劑，用於已對除草劑之植物毒性效應具有抗性或經過重組方式而具有抗性之有用植物中。

相較於現有植物，產生具有改造性質之新穎植物之常用方式為例如：傳統育種法及突變株形成法。或者，可藉助於重組法產生具有改造性質之新穎植物(參見例如：EP-A-0221044、EP-A-0131624)。例如：已說明基於改造植物中所合成澱粉目的之幾種基因改造作物(例如：WO 92/011376 A、WO 92/014827 A、WO 91/019806 A)，透過“基因堆疊(gene stacking)”而對特定固殺草(glufosinate)型(參見例如：EP 0242236 A、EP 0242246 A)或嘉磷塞(glyphosate)型(WO 92/000377A)或磺醯脲型(EP 0257993 A、US 5,013,659)特定除草劑或對此等除草劑之組合或混合物具有抗性之轉殖基因作物，如，例如：商品名稱或指名為 Optimum™ GAT™ (嘉磷塞 ALS 耐受性)之玉米或大豆之轉殖基因作物，

- 可以產生蘇雲金芽孢桿菌(*Bacillus thuringiensis*)毒素(Bt 毒素)之轉殖基

因作物，例如：棉花，使植物對特定有害生物具有抗性(EP-A-0142924、EP-A-0193259)，

- 具有改造之脂肪酸組成之轉殖基因作物(WO 91/013972 A)，
- 具有新穎之組成份或二次代謝物(例如：新穎之植物防禦素)之基因改造作物，其會提高病害抗性(EP 0309862 A、EP 0464461 A)，
- 減少光呼吸作用而提高產量及提高逆境壓力抗性之基因改造植物(EP 0305398 A)，
- 產生具有醫藥或診斷重要性之蛋白質之轉殖基因作物("分子醫藥農場(molecular pharming)")，
- 其特徵在於提高產量或改良品質之轉殖基因作物，
- 其特徵在於組合例如：上述新穎性質("基因堆疊")之轉殖基因作物。

用於產生具有改造性質之新穎轉殖基因植物之許多種分子生物技術係原則上已知者；參見例如：I. Potrykus 及 G. Spangenberg (編輯)之"植物之基因轉移(Gene Transfer to Plants)，Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg 或 Christou 之"植物科學趨勢(Trends in Plant Science)" 1 (1996) 423-431)。

為了進行此重組操作法，可能引進核酸分子至質體中，可以進行誘變法或利用 DNA 序列之重組法改造序列。例如：可以藉助於標準方法進行鹼基交換法、可移除部份序列、或添加天然或合成之序列。為了彼此連接 DNA 片段，可以在片段上添加適體或連接體；參見例如：Sambrook 等人之 1989，分子選殖法，實驗手冊(Molecular Cloning, A Laboratory Manual)，第 2 版，Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY;或 Winnacker 之"基因與純系(Gene und Klone)"，VCH Weinheim 第 2 版，1996。

可例如：藉由至少一種適當之反義 RNA、或有義 RNA 之表現來達成共同壓制之效應或藉由至少一種適當構築之核酶(其專一性裂解上述基因產物之轉錄本)之表現，產生具有降低基因產物活性之植物細胞。其作法可先

使用包含基因產物之所有編碼序列(包括任何可能存在之側接序列)之 DNA 分子或僅包含部份編碼序列之 DNA 分子，該等部份編碼序列之長度必需足以在細胞中產生反義效應。亦可能使用與基因產物之編碼序列具有高度同質性，但不完全相同之 DNA 序列。

當植物中表現核酸分子時，所合成之蛋白質可位於植物細胞之任何間隔中。然而，為了定位在特定間隔內，可以例如：連接編碼區與 DNA 序列，以確保定位在特定間隔內。此等序列係熟悉此相關技術者已知者(參見例如：Braun 等人之 EMBO J. 11 (1992), 3219-3227; Wolter 等人之 Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850; Sonnewald 等人之 Plant J. 1 (1991), 95-106)。核酸分子亦可表現在植物細胞之細胞器中

轉殖基因植物細胞可利用已知技術再生，產生完整植物。原則上，轉殖基因植物可為任何植物品種，亦即包括單子葉或雙子葉植物。因此，所得到之轉殖基因植物可能具有因同源性(=天然)基因或基因序列之過度表現、壓制或抑制或因異源性(=外來)基因或基因序列之表現結果所致之改變性質。

本發明化合物(I)較佳用於對以下物質具有抗性之轉殖基因作物：生長調節劑(例如：2,4-D、汰克草(dicamba))；或抑制基本植物酵素之除草劑(例如：乙醯乳酸合成酶(ALS)、EPSP 合成酶、麩醯胺合成酶(GS)或羥苯基丙酮酸二氧合酶(HPPD))；或來自磺醯基脲類、嘉磷塞(glyphosate)、固殺草(glufosinate)或苯甲醯基異嘧啶類之除草劑、及類似活性成份、或此等活性成份之任何所需組合。

本發明化合物特別適用於對嘉磷塞與固殺草之組合、對嘉磷塞與磺醯基脲類或咪唑啉酮類之組合具有抗性之轉殖基因作物。最佳為本發明化合物可用於例如：商品名稱或指定名稱為 Optimum TM GATM(嘉磷塞 ALS 耐受性)之轉殖基因作物，如：玉米或大豆。

當根據本發明活性成份用於轉殖基因作物時，除了可在其他作物中觀

察到其對有害植物之效應外，亦經常可觀察到施用在特定轉殖基因作物時之特定效應，例如：經修改或特異化之擴大雜草控制範圍、修改可採用之施用率、與除草劑抗性轉殖基因作物之良好可組合性及對轉殖基因作物生長與產量之影響。

因此本發明亦有關一種以本發明式(I)化合物及式(Ia)化合物作為除草劑於控制轉殖基因作物中有害植物上之用途。

本發明化合物可呈可濕性粉劑、可乳化濃縮劑、噴灑液、塵粉劑或粒劑等型式用於習用調配物中。因此本發明亦有關包含本發明化合物之除草劑及植物生長調節劑。

本發明化合物可依各種不同方式調配，端賴所需之生物與/或生理-化學參數而定。可能之調配物實例包括例如：可濕性粉劑(WP)、水溶性粉劑(SP)、水溶性濃縮劑、可乳化濃縮劑(EC)、乳液(EW)(如：水包油及油包水性乳液)、噴灑液、水懸劑(SC)、油性或水性分散液、油混溶性溶液、膠囊懸浮液(CS)、塵粉劑(DP)、拌種產品、撒播用粒劑及土壤用粒劑、呈微粒型式之粒劑(GR)、噴灑粒劑、包衣粒劑及吸附粒劑、水分散性粒劑(WG)、水溶性粒劑(SG)、ULV 調配物、微膠囊及蠟類。此等個別調配物型式係原則上已知者且說明於例如：Winnacker-Küchler 之"Chemische Technologie" [化學技術]，第7冊，C. Hanser Verlag Munich，第4版，1986；Wade van Valkenburg 之"農藥調配物(Pesticide Formulations)"，Marcel Dekker, N.Y., 1973；K. Martens 之"噴霧乾燥法(Spray Drying)"手冊，第3版，1979, G. Goodwin Ltd. London。

所需之調配輔劑(如：惰性材料、表面活性劑、溶劑及其他添加劑)亦係已知者且說明於例如：Watkins 之"殺昆蟲塵粉劑稀釋劑與載劑手冊(Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers)"，第2版，Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen 之"黏土膠體化學入門(Introduction to Clay Colloid Chemistry)"，第2版，J. Wiley & Sons, N.Y.；C. Marsden 之"溶劑指南(Solvents Guide)"，第2版，Interscience, N.Y. 1963；McCutcheon 之"清潔劑與乳化劑

年報(Detergents and Emulsifiers Annual)", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J. ; Sisley 及 Wood 之 "表面活性劑大全(Encyclopedia of Surface Active Agents)", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964 ; Schönfeldt 之 "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte" [環氧乙烷加合物表面活性劑], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976 ; Winnacker-Küchler 之 "Chemische Technologie" [化學技術], 第 7 冊, C. Hanser Verlag Munich, 第 4 版, 1986。

依據此等調配物，亦可能與其他農藥活性成份(例如：殺昆蟲劑、殺蟬蟎劑、除草劑、殺真菌劑)，及與安全劑、肥料及/或生長調節劑製成組合，例如：現成混合物或大槽混合物。合適安全劑為例如：吡啶解草酯(mefenpyr-diethyl)、環丙磺醯胺(cyprosulfamide)、雙苯噁唑酸(isoxadifen-ethyl)、毒嗒(cloquintocet-mexyl)及二氯丙烯胺(dichlormid)。

可濕性粉劑為可均勻分散在水中之製劑，其中除了活性成份外，亦包含離子性與/或非離子性表面活性劑(濕化劑、分散劑)，例如：除了稀釋劑或惰性物質外，尚包含聚氧乙基化烷基酚類、聚氧乙基化脂肪醇類、聚氧乙基化脂肪胺類、脂肪醇聚二醇醚硫酸酯類、烷磺酸酯類、烷基苯磺酸酯類、木質素磺酸鈉、2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸鈉、二丁基萘磺酸鈉或油醯基甲基牛磺酸鈉。為了製備可濕性粉劑，取除草活性成份例如：於習知設備(如：錘磨機、碗磨機及氣壓噴射研磨機)中均勻細磨，並與調配輔劑同時或依序混合。

可乳化濃縮劑之製法為取活性成份溶於有機溶劑中，例如：丁醇、環己酮、二甲基甲醯胺、二甲苯或相當高沸點芳香系或烴類或添加一或多種離子性與/或非離子性表面活性劑(乳化劑)之有機溶劑混合物。可使用之乳化劑實例為：烷芳基磺酸鈣(如：十二烷基苯磺酸鈣)或非離子性乳化劑(如：脂肪酸聚二醇酯類、烷芳基聚二醇醚類、脂肪醇聚二醇醚類、氧化丙烯/環氧乙烷縮合物、烷基聚醚類、山梨糖醇酐酯類(如，例如：山梨糖醇酐脂肪酸酯類)或聚氧乙烯山梨糖醇酐酯類(如，例如：聚氧乙烯山梨糖醇酐脂肪酸

酯類)。

塵粉劑製法係由活性成份與細碎固體物質，例如：滑石、天然黏土(如：高嶺土、皂土與葉蠟石)、或矽藻土混合。

水懸劑可為水性或油性。其可例如：利用自商品取得之球磨機，可視需要添加上列表面活性劑(例如：說明於其他調配物型態中者)，進行濕磨法製得。

乳液，例如：水包油性乳液(EW)之製法可例如：利用攪拌器、膠體研磨機及/或靜態混合器，使用水性有機溶劑，可視需要添加上列表面活性劑(例如：說明於其他調配物型態中者)。

粒劑製法可由活性成份噴灑在吸附性粒狀惰性材料上，或藉助於黏著劑(例如：聚乙烯醇、聚丙烯酸鈉或礦物油類)，將活性成份濃縮劑塗覆在載劑(如：砂、高嶺土或粒狀惰性材料)表面上。合適之活性成份亦可依習知之肥料顆粒製法(若需要時，可與肥料形成混合物)製成顆粒。

水分散性粒劑通常採用習知方法製造，如：噴霧乾燥法、流化床製粒法、盤式製粒法、使用高速攪拌器混合、及在不使用固態惰性材料下進行擠壓。

盤式粒劑、流化床粒劑、擠壓粒劑與噴霧乾燥粒劑之製法可參見例如："噴霧乾燥法手冊(Spray-Drying Handbook)"，第3版，1979，G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning 之"凝集法(Agglomeration)"，Chemical and Engineering 1967，第147頁以後；"派氏化學工程手冊(Perry's Chemical Engineer's Handbook)"，第5版，McGraw-Hill, New York 1973, p. 8-57 中說明之方法。

有關作物保護組成物之調配物之進一步詳細說明可參見例如：G.C. Klingman 之"雜草控制學(Weed Control as a Science)"，John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961，第81-96頁及 J.D. Freyer、S.A. Evans 之"雜草控制手冊(Weed Control Handbook)"，第5版，Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968，第101-103頁。

通常，農化製劑包含 0.1 至 99%重量比，尤指 0.1 至 95%重量比之本發明化合物。可濕性粉劑中，活性成份濃度為例如：約 10 至 90%重量比，其餘由習知調配物組成份補足 100%重量比。可乳化濃縮劑中，活性成份濃度可佔約 1 至 90%，較佳佔 5 至 80%重量比。塵粉劑型之調配物可包含 1 至 30%重量比之活性成份，通常較佳包含 5 至 20%重量比活性成份；噴灑液包含約 0.05 至 80%重量比，較佳 2 至 50%重量比之活性成份。水分散性粒劑例子中，活性成份含量係部份依活性化合物呈液態或固態而定，且依所採用之製粒輔劑、填料，等等而定。水分散性粒劑中，活性成份含量為例如：1 至 95%重量比之間，較佳為 10 至 80%重量比之間。

此外，上述活性成份調配物可視需要包含各例中常用之黏著劑、濕化劑、分散劑、乳化劑、滲透劑、防腐劑、防凍劑與溶劑、填料、載劑與著色劑、消泡劑、蒸發抑制劑、及影響 pH 與黏度之製劑。

依據此等調配物，其亦可與其他農藥活性物質(如，例如：殺昆蟲劑、殺蟬蟎劑、除草劑、殺真菌劑)，及與安全劑、肥料及/或生長調節劑製成組合，例如：現成混合物或大槽混合物型式。

使用呈商品型態之調配物時，若適當時可依習知方式稀釋，例如：可濕性粉劑、可乳化濃縮劑、分散劑及水分散性粒劑等例係使用水稀釋。呈塵粉劑、施用至土壤之粒劑、撒播粒劑及噴灑液型式之製劑通常在施用前不再使用其他惰性物質稀釋。

所需之式(I)化合物施用率會隨外部條件變化，如：溫度、濕度、所採用除草劑型態，等等。其可在很大限制範圍內變化，例如：0.001 至 1.0 kg/ha 或更高之活性物質之間，但較佳在 0.005 至 750 g/ha 之間。

除了除草性質外，本發明化合物亦具有良好之殺真菌性質。本發明因此亦有關一種包含本發明活性成份來控制不要之微生物之組成物。較佳係包含農業上適用之輔劑、溶劑、載劑、表面活性劑或補充劑之殺真菌組成物。

此外，本發明亦係有關一種控制不要之微生物之方法，其包括施加本發明活性成份至植物病原性真菌與/或其棲息地上。

根據本發明，載劑係天然或合成之有機或無機物質，其係為了改善施用性而與活性成份混合或組合，特定言之用於施用至植物或植株部份或種子。該等載劑可為固態或液態，且通常為惰性且應適用於農業。

適用之固態或液態載劑包括例如：銨鹽及天然礦物粉末，如：高嶺土、黏土、滑石、白堊、石英、矽鎂土、蒙脫土或矽藻土，及合成礦物粉末，如：高分散度矽石、氧化鋁與天然或合成矽酸鹽、樹脂、蠟類、固體肥料、水、醇類(尤指丁醇)、有機溶劑、礦物油與植物油及其衍生物。亦可使用此等載劑之混合物。適用於粒劑之固態載劑為例如：粉碎與分碎天然礦石，如：方解石、大理石、浮石、海泡石、白雲石，及無機與有機粉末之合成顆粒，及有機材料之顆粒如：鋸屑、椰子殼、玉米穗軸與菸草桿。

適用之液化氣體補充劑或載體係指常溫常壓下呈氣態之液體，例如：氣霧劑推進劑，如：鹵烴類及丁烷、丙烷、氮氣與二氧化碳。

調配物中可使用膠黏劑，如：羧甲基纖維素、粉狀、粒狀或似膠乳狀之天然與合成聚合物，如：阿拉伯膠、聚乙烯醇、聚乙酸乙烯酯與天然磷脂類，如：腦磷脂與卵磷脂，與合成之磷脂類。其他添加劑可為礦物油或植物油。

當使用水作為補充劑時，亦可使用例如：有機溶劑作為輔助溶劑。基本上適用之液態溶劑為：芳香族化合物(如：二甲苯或甲苯)、或烷基萘類、氯化芳香烴類或氯化脂族烴類(如：氯苯、氯化乙烯或二氯甲烷)、脂族烴類(如：環己烷或石蠟，例如：礦物油分餾物、礦物油與植物油)、醇類(如：丁醇或甘醇，及其醚類與酯類)、酮類(如：丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮或環己酮)、強極性溶劑(如：二甲基甲醯胺與二甲亞砷)，及水。

本發明組成物亦可包含其他組份，例如：表面活性劑。合適之界面活性劑為具有離子性質或非離子性質之乳化劑與/或泡沫形成劑、勻散劑或濕

化劑，或此等界面活性劑之混合物。其實例為：聚丙烯酸之鹽類、木質素磺酸之鹽類、苯酚磺酸或萘磺酸之鹽類、環氧乙烷與脂肪醇或與脂肪酸或與脂肪胺之聚縮合物、經取代之苯酚類(較佳係烷基酚或芳基酚)、磺代琥珀酸酯之鹽類、牛磺酸衍生物(特定言之牛磺酸烷基酯)、聚乙氧基化醇或苯酚之磷酸酯、多元醇之脂肪酸酯，及包含硫酸根、磺酸根與磷酸根之化合物之衍生物，例如：烷基芳基聚二醇醚、烷基磺酸酯、烷基硫酸酯、芳基磺酸酯、蛋白質水解物、木質素亞硫酸鹽廢液及甲基纖維素。當活性成份與/或其中一種惰性載體不可溶於水且當該使用水施用時，需要包含界面活性劑。界面活性劑之比例可占本發明組成物重量之 5%至 40%重量比。亦可使用染劑，如：無機色素，例如：氧化鐵，氧化鈦與普魯士藍，及有機染劑，如：茜素染劑、偶氮染劑與金屬酞花青染劑，及微量營養素如：鐵、錳、硼、銅、鈷、鋁與鋅之鹽類。

若適當時，亦可包含其他成份，例如：保護性膠體、結合劑、膠黏劑、增稠劑、搖變物質、滲透劑、安定劑、螯合劑、錯化物形成劑。通常，活性成份可配合調配目的，與任何常用之固態或液態添加劑組合。通常，本發明組成物及調配物包含 0.05 至 99%重量比、0.01 至 98%重量比，較佳係 0.1 至 95%重量比及更佳係 0.5 至 90%重量比之間之活性成份，最佳係 10 至 70%重量比。本發明成份或組成物可呈其原型或依其特定物理與/或化學性質呈其調配物形式或呈其所製成之使用形式使用，如：氣霧劑、膠囊懸浮液、冷霧濃縮劑、熱霧濃縮劑、包埋粒劑、細粒劑、用於處理種子之水懸濃縮劑、現成即用型溶液、塵粉劑、乳化濃縮劑、水包油性乳液、油包水性乳液、大粒劑、微粒劑、油勻散性粉劑、油相容性水懸濃縮劑、油相容性液體、泡沫劑、糊劑、包覆農藥之種子、懸浮濃縮劑、懸浮乳液濃縮劑、可溶性濃縮劑、懸浮液、噴灑粉劑、可溶性粉劑、塵粉劑與粒劑、水溶性粒劑或錠劑、用於處理種子之水溶性粉劑、可濕化粉劑、浸泡過活性成份之天然產物與合成物質、及含在聚合性物質中與種子包衣中之微包埋

物、及 ULV-冷霧與熱霧調配物。

上述調配物可依本身已知方式製造，例如：混合活性成份與至少一種常用之補充劑、溶劑或稀釋劑、乳化劑、勻散劑、與/或結合劑或固定劑、濕化劑、驅水劑，可視需要使用乾燥劑與 UV 穩定劑，且可視需要選用染劑與色素、消泡劑、防腐劑、二次增稠劑、膠黏劑、赤霉素，及其他加工助劑。

本發明組成物不僅包含可利用適當設備施用至植物或種子之現成即用型組成物，而且包含必需在使用前加水稀釋之濃縮劑商品。

本發明活性成份可呈其本身或其調配物(標準商品)，或由此等調配物與其他(已知)活性成份形成混合物之施用形式，該其他活性成份為如：殺昆蟲劑、誘餌、不孕劑、殺細菌劑、殺蟬蟎劑、殺線蟲劑、殺真菌劑、生長調節劑、除草劑、肥料、安全劑、與/或化學信息物質。

本發明使用活性成份或組成物處理植物與植株部份之處理法係採用習知處理法直接處理或作用在其環境、棲息地或庫存空間，例如：浸泡、噴灑、噴霧、灌注、蒸發、撒粉、氣霧、撒佈、發泡、塗刷、分散、澆注(浸藥)、滴灌，且若為繁殖材料時，尤其處理種子時，其亦可採用乾式種子處理法、濕式種子處理法、漿物處理法、包殼法、包覆一或多層包衣，等等。亦可能採用超低體積法施用活性成份，或將活性成份製劑或活性成份本身注射至土壤中。

本發明進一步包括處理種子之方法。

本發明進一步係有關接受前一段說明之其中一種方法處理之種子。本發明種子係用於保護種子免於不要之微生物侵害之方法。此等方法中，採用接受至少一種本發明活性成份處理之種子。本發明活性成份或組成物亦適合處理種子。大多數作物植株之傷害係在種子存放期間、種子播種後、植株發芽期間與發芽後受到感染所造成。此時期特別重要，因為成長中之植物之根與芽特別敏感，即使細微傷害亦可能造成植株死亡。因此使用合

適組成物保護種子及發芽中之植物係特別值得重視之作法。

長久以來已知藉由處理植物種子來控制植物病原性真菌且仍在改良中。然而，處理種子時，經常出現一些無法以令人滿意之方式解決之問題。例如：需要發展一種可以在播種後或植物萌發後免除或至少顯著減少另外施用作物保護劑之保護種子及發芽植物之方法。亦需要使活性成份以最適當用量提供種子及發芽植物最大保護程度，以免植物病原性真菌侵害，且不受所使用活性成份傷害植物本身。特定言之，處理種子之方法亦應考量轉殖基因植物固有之殺真菌性質，以便在最低之作物保護劑組成物用量下，對種子及發芽植物達最適當保護程度。

因此本發明亦有關使用本發明組成物處理種子，以保護種子與發芽植物免於植物病原性真菌侵害之方法。本發明亦有關以本發明組成物處理種子，以保護種子與發芽植物免於植物病原性真菌侵害之方法。本發明進一步係有關接受本發明組成物處理以保護對抗植物病原性真菌之種子。

會傷害出土後植物之植物病原性真菌之控制法主要係使用作物保護劑組成物處理土壤與植物之地上部植株。由於考量作物保護劑組成物對環境及人類與動物之健康可能造成影響，應儘量降低活性成份施用量。

本發明優點之一在於基於本發明活性成份與組成物之特殊全株性質，經過此等活性成份與組成物處理之種子不僅可保護種子本身，而且可保護出土後所長成植株，免於植物病原性真菌侵害。依此方式，即不需要在播種期間或播種後短時間內立即處理作物。

同樣地，其優點在於本發明活性成份或組成物尤其亦可用於轉殖基因種子，使由此等種子長成之植物可表現對抗有害生物之蛋白質。藉由使用本發明活性成份或組成物處理此等種子，僅藉由蛋白質(例如：殺昆蟲性蛋白質)之表現即可控制某些有害生物。驚人地發現，除了提高對抗有害生物之保護效力外，亦在此例中進一步觀察到協乘效應。

本發明組成物適合保護任何用於農業、溫室、森林或園藝與葡萄栽培

之植物品種之種子。特定言之，該等種子係指穀類(如：小麥、大麥、裸麥、硬粒小麥、高粱/小米與燕麥)、玉米、棉花、大豆、稻、馬鈴薯、葵花、豌豆、咖啡、甜菜(例如：製糖用甜菜與飼料用甜菜)、花生、油菜、罌粟、橄欖、椰子、可可、甘蔗、菸草、蔬菜(如：番茄、胡瓜、洋蔥與萵苣)、草皮與觀賞植物(參見下文)之種子。特別重要為處理穀類(如：小麥、大麥、裸麥、硬粒小麥與燕麥)、玉米與稻之種子。

亦如上述，本發明活性成份或組成物對轉殖基因種子之處理法特別重要。此時，該植物之種子包含至少一個可以表現具有殺昆蟲性質之多肽或蛋白質之異源基因。轉殖基因種子中之異源基因可源自例如下列微生物屬種：桿菌(*Bacillus*)、根瘤菌(*Rhizobium*)、假單胞菌(*Pseudomonas*)、沙雷氏菌(*Serratia*)、木黴(*Trichoderma*)、棒形桿菌(*Clavibacter*)、菌根菌(*Glomus*)或黏帚黴(*Gliocladium*)。以來自桿菌(*Bacillus*)屬之異源基因較佳，其中該基因產物可有效對抗歐洲玉米螟與/或玉米根蟲。以來自蘇雲金芽胞桿菌(*Bacillus thuringiensis*)之異源基因更佳。

本發明內容中，本發明組成物係單獨施用或含於合適調配物中施用至種子上。接受處理之種子最好處於充份穩定狀態，以免在處理期間損傷。通常，可在收穫至播種期間任何時間點處理種子。所採用之種子通常已與植株分離且沒有軸、殼、稈、包衣、穗或果肉。例如：可採用已經過採收、清潔且乾燥至低於15重量%水份含量之種子。或者亦可使用乾燥後之種子，例如：經過水處理後再度乾燥之種子。

通常在處理種子時，必需確保所選擇施用至種子之本發明組成物施用量與/或其他添加劑之施用量不會破壞種子發芽且不會傷害由其長成之植物。尤其當活性成份在特定施用率下具有植物毒性時，應該確保此點。

本發明組成物可直接施用，亦即沒有任何其他成份且未稀釋即使用。通常，最好以合適調配物型式施用組成物至種子上。處理種子之合適調配物與方法係習此相關技藝之人士習知者，且說明於例如：下列文獻：US

4,272,417 A、US 4,245,432 A、US 4,808,430、US 5,876,739、US 2003/0176428 A1、WO 2002/080675 A1、WO 2002/028186 A2。

根據本發明可使用之活性成份可轉換成常用拌種調配物，如：溶液、乳液、懸浮液、粉劑、發泡劑、漿物或種子之其他包衣組成物，與 ULV 調配物。

此等調配物可依已知方式製造，混合活性成份與一般添加劑，例如：常用之補充劑，及溶劑或稀釋劑、染劑、濕化劑、勻散劑、乳化劑、消泡劑、防腐劑、二次增稠劑、膠黏劑、赤霉素，及水。

根據本發明可使用之拌種調配物中可包含之染劑為此等目的常用之所有染劑。可使用難溶於水之色素，或可使用水溶性染劑。其實例包括彼等名稱為若丹明 B(Rhodamin B)、C.I.紅色(Pigment Red)112 號與 C.I.溶劑紅(Solvent Red)1 號之染劑。

根據本發明可使用之拌種調配物中可包含之濕化劑為可促進濕化及調配農化活性成份時常用之所有物質。較佳為使用萘磺酸烷基酯類，如：萘磺酸二異丙基酯或-二異丁基酯。

根據本發明可使用之拌種調配物中適用之勻散劑與/或乳化劑為調配農化活性成份時常用之所有非離子性、陰離子性與陽離子性勻散劑。較佳為使用非離子性或陰離子性勻散劑或非離子性或陰離子性勻散劑之混合物。合適之非離子性勻散劑尤其包括環氧乙烷/氧化丙烯嵌段聚合物，烷基苯酚聚二醇醚與三苯乙烯苯酚聚二醇醚，及其磷酸化或硫酸化衍生物。合適之陰離子性勻散劑尤其指木質素磺酸鹽、聚丙烯酸鹽與芳基磺酸鹽/甲醛縮合物。

根據本發明可使用之拌種調配物中可包含之消泡劑為調配農化活性成份時常用之所有抑制泡沫物質。較佳為使用聚矽氧消泡劑與硬脂酸鎂。

根據本發明可使用之拌種調配物中可包含之防腐劑為農化組成物中為了此等目的常用之所有物質。其實例包括二氯吩(dichlorophen)與苯甲醇半

縮甲醛。

根據本發明可使用之拌種調配物中可包含之二次增稠劑為農化組成物中為了此等目的常用之所有物質。較佳實例包括纖維素衍生物、丙烯酸衍生物、黃原膠、改質黏土與細分散性矽石。

根據本發明可使用之拌種調配物中可包含之膠黏劑為拌種產品中常用之所有結合劑。較佳實例包括聚乙烯基吡咯啉酮、聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇，與纖維基乙酸鈉(tylose)。

根據本發明可使用之拌種調配物可直接使用或加水稀釋後使用，用於處理各種不同種子，包括轉殖基因植物之種子。此例中，亦可能與透過表現所形成之物質發生交互作用而另外產生協乘效應。

根據本發明可使用之拌種調配物或其加水後所製成製劑用於處理種子時，可使用所有常用於拌種之混合裝置。明確言之，該拌種法為將種子置入混合機中，添加所需拌種調配物用量，可直接添加或先加水稀釋後添加，混合混合機內容物，直到調配物均勻分佈在種子上為止。若適當時，可接著進行乾燥過程。

本發明活性成份或組成物具有強力之殺微生物活性，可用於控制不要之微生物，如：作物保護法與材料保護法中之真菌與細菌。

殺真菌劑可用於作物保護法中來控制：根腫菌(Plasmodiophoromycetes)、卵菌(Oomycetes)、壺菌(Chytridiomycetes)、接合菌(Zygomycetes)、子囊菌(Ascomycetes)、擔子菌(Basidiomycetes)與半知菌(Deuteromycetes)。

可使用殺細菌劑保護作物，控制：假單胞菌科(Pseudomonadaceae)、根瘤菌科(Rhizobiaceae)、腸桿菌科(Enterobacteriaceae)、棒狀桿菌科(Corynebacteriaceae)與鏈黴菌科(Streptomyetaceae)。

本發明殺真菌組成物可用於治癒性或保護性控制植物病原性真菌。因此本發明亦有關利用本發明活性成份或組成物治癒性及保護性控制植物病原性真菌，其係施用至種子、植物或植株、果實或種植植物之土壤中。

在作物保護中控制植物病原性真菌之本發明組成物包含有效但非植物毒性量之本發明活性成份。“有效但非植物毒性量”係指本發明組成物足以以令人滿意之方式控制植物之真菌病害或完全根除真菌病害，同時不會引起任何顯著植物毒性症狀時之用量。通常，此施用率可能在相當大範圍內變化。其依許多因素變化，例如：所控制之真菌、植物、氣候條件與本發明組成物之成份。

活性成份在控制植物病害時所需濃度下之植物耐受性良好，使其適合處理植物地上部、繁殖莖與種子，及土壤。

本發明可用於處理所有植物與植株部份。咸了解，植物係指所有植物及植物族群，如：需要及不需要之野生植物及作物(包括天然作物)。作物可為依傳統育種法及優化法或採用生物技術法與遺傳工程法或此等方法之組合所取得者，包括轉殖基因植物及植物栽培品種(其係受到或未受到植物育種者權益保護)。應咸了解，植株部份意指植物之所有地上及地下部份與器官，如：芽、葉、花、與根，其實例包括：闊葉、針葉、莖、分枝、花、果實體、果實、種子、根、球莖與根莖。植株部份亦包括已收成材料及無性與有性繁殖材料，例如：壓條、球莖、根莖、藤蔓與種子。

本發明活性成份具有良好之植物相容性，對恆溫動物具有有利之毒性，及與環境之良好相容性，適合保護植物與植物器官，提高收成產量，改良收成作物品質。其適用為作物保護組成物。其可有效對抗一般敏感性與抗性品種，及對抗所有或有些發展階段。

可根據本發明處理之植物包括下列主要作物植物：玉米、大豆、棉花、蕓苔科油菜籽，如：甘藍型油菜(*Brassica napus*)(例如：芥花)、小松菜(*Brassica rapa*)、葉用芥菜(*B. juncea*)(例如：芥菜)與埃塞俄比亞芥(*Brassica carinata*)、稻、小麥、甜菜、甘蔗、燕麥、裸麥、大麥、小米與高粱、硬粒小麥、亞麻、葡萄與植物分類上之各種水果與蔬菜，例如：薔薇科(*Rosaceae*)屬類(例如：梨果類，如：蘋果與梨，但亦包括核果類，如：杏桃、櫻桃、杏仁、

李與桃，及莓果類，如：草莓)、*Ribesioideae* 屬類、胡桃科(*Juglandaceae*)屬類、樺木科(*Betulaceae*)屬類、漆樹科(*Anacardiaceae*)屬類、殼斗科(*Fagaceae*)屬類、桑科(*Moraceae*)屬類、木犀科(*Oleaceae*)屬類、獼猴桃科(*Actinidaceae*)屬類、樟科(*Lauraceae*)屬類、芭蕉科(*Musaceae*)屬類(例如：香蕉樹與香蕉園)、茜草科(*Rubiaceae*)屬類(例如：咖啡)、山茶科(*Theaceae*)屬類、梧桐科(*Sterculiaceae*)屬類、芸香科(*Rutaceae*)屬類(例如：檸檬、柳橙與葡萄柚)；茄科(*Solanaceae*)屬類(例如：番茄、馬鈴薯、甜椒、茄子)、百合科(*Liliaceae*)屬類、菊科(*Compositae*)屬類(例如：萵苣、朝鮮薊與菊苣-包括根用菊苣、菊萵苣或野苦苣)、繖形科(*Umbelliferae*)屬類(例如：胡蘿蔔、荷蘭芹、芹菜與肥根芹菜)、葫蘆科(*Cucurbitaceae*)屬類(例如：胡瓜-包括小黃瓜、南瓜、西瓜、葫蘆與香瓜)、蔥科(*Alliaceae*)屬類(例如：韭菜與洋葱)、十字花科(*Cruciferae*)屬類(例如：白色捲心菜、紅色捲心菜、綠花椰菜、白花椰菜、球芽甘藍、小白菜、大頭菜、蘿蔔、山葵、獨行菜與大白菜)、豆科(*Leguminosae*)屬類(例如：花生、豌豆與豆類，如：爬藤豆類與蠶豆)、藜科(*Chenopodiaceae*)屬類(例如：瑞士甜菜、飼料用甜菜、菠菜、甜菜根)、錦葵科(*Malvaceae*)屬類(例如：秋葵)、天門冬科(*Asparagaceae*)屬類(例如：蘆筍)；花園之有用植物與觀賞植物與木材；及此等植物之各基因改造型態。

如上述，根據本發明可處理所有植物與其植株部份。較佳具體實施例中係處理野生植物品種與植物栽培品種或彼等由傳統生物育種法(如：交配法或原生質融合法)取得者，與其植株部份。另一項較佳具體實施例中，係處理由遺傳工程法(若適當時，可併用傳統方法)得到之轉殖基因植物與植物栽培品種(基因改造生物體)，及其植株部份。術語"部份"或"植株部份"或"部份植株"已如上述說明。更佳者，根據本發明係處理自商品取得或使用中之植物栽培品種之植物。咸瞭解，植物栽培品種意指經由傳統育種法、誘變法或重組 DNA 技術得到之具有新穎性質("性狀")之植物。其可為生物型或基因型栽培品種、變異種。

根據本發明之處理法可用於處理基因改造生物體(GMO)，例如：植物或種子。基因改造植物(或轉殖基因植物)為植物中異源基因已穩定整合進入基因組中。術語“異源基因”基本上係指將所提供之基因或在植株外組成之基因引入轉殖基因植物之細胞核基因組、葉綠素基因組或粒線體基因組中，藉由表現所需蛋白質或多肽，或下調或靜默處理植物中其他基因(群)(例如：利用反義技術、共壓抑技術或 RNAi 技術[RNA 干擾])，使所轉化之植物賦與新穎或改良之農藝或其他性質。存在於基因組中之異源基因亦稱為轉殖基因。被界定在植物基因組中特定位置之轉植基因稱為轉化或轉殖基因品項。

依植物品系或植物栽培品種、其位置與其生長條件(土壤、氣候、生長期、營養)而定，根據本發明處理法亦可造成超加成性(“協乘性”)效力。因此，例如：可能出現下列超過實際所預期之效力：降低施用率與/或擴大活性範圍與/或提高根據本發明可使用活性成份與組成物之活性、改善植物生長、提高對高溫或低溫之耐受性、提高對乾旱或水或土壤鹽份之耐受性、提高開花率、簡化收成、加速成熟、提高產量、增大果實、增加植物高度、加深葉子綠色、提早開花、改善所收成產品之品質與/或提高營養價值、提高果實糖度、改善所收成產品之儲存能力與/或可加工性。

在某些施用率下，根據本發明組成物亦可能具有強化植物之效力。因此，其亦適合傳遞植物之防禦系統來對抗不要之植物病原性真菌之侵害。若適當時，此點可能成為加強根據本發明組成物活性之理由之一，例如：對抗真菌。咸了解，本文中強化植物(誘發抗性)之物質亦指彼等可依此方式刺激植物之防禦系統之物質或物質之組合，當隨後接種不要之植物病原性真菌時，經處理過之植物即對此等不要之植物病原性真菌展現顯著之抗性程度。因此，本發明物質可在處理後某一段時期內，用於保護植物對抗上述病原菌之侵害。可產生保護作用之效期通常在使用活性成份處理植物後持續 1 至 10 天，較佳為 1 至 7 天。

較適合根據本發明處理之植物與植物栽培品種包括具有可以賦與此等植物特別有利且適用性狀之遺傳材料之所有植物(不論經由育種與/或生物技術方式取得者)。

亦適合根據本發明處理之植物與植物栽培品種為彼等對一種或多種生物性逆境壓力因子產生抗性之植物，亦即該等植物對動物與微生物病害展現更佳防禦性，如：對抗線蟲、昆蟲、蟎、植物病原性真菌、細菌、病毒與/或類病毒。

對線蟲具有抗性之植物說明於例如：下列美國專利申請案：11/765,491、11/765,494、10/926,819、10/782,020、12/032,479、10/783,417、10/782,096、11/657,964、12/192,904、11/396,808、12/166,253、12/166,239、12/166,124、12/166,209、11/762,886、12/364,335、11/763,947、12/252,453、12/209,354、12/491,396 及 12/497,221。

亦可根據本發明處理之植物與植物栽培品種為彼等對一種或多種非生物性逆境壓力因子產生抗性之植物。非生物性逆境壓力條件可包括例如：乾旱、曝露在低溫下、曝露在高溫下、滲透壓逆境、水患、土壤鹽份提高、曝露到礦物濃度提高、曝露到臭氧、曝露到強光、氮營養素利用度受限、磷營養素利用度受限或避蔭反應。

亦可根據本發明處理之植物與植物栽培品種為彼等特徵在於加強收成特性之植物。加強該等植物收成之方法可為例如：改善植物生理、改善植物生長與發展，如：水利用效率、水保留效率、改善氮利用率、加強碳同化作用、改善光合作用、提高發芽效率與加速成熟。可進一步藉由改善植物結構(承受逆境壓力下與無逆境壓力條件下)來改善收成，包括(但不限於)：提早開花、控制開花以產生雜交種子、幼苗生長力、植物大小、節間數量與距離、根部生長、種子大小、果實大小、果莢大小、果莢或穗數量、每莢或每穗之種子數量、種子生質量、加強種子飽實度、減少種子散落、減少果莢開裂與倒伏抗性。其他產物性狀包括種子組成，如：碳水化合物含

量、蛋白質含量、油含量與組成、營養價值、降低不良營養素化合物、改善可加工性及改善儲存安定性。

可根據本發明處理之植物為已表現雜種優勢或雜交效力特性之雜交植物，一般可提高產量、生長力、改善健康及對生物性與非生物性逆境壓力因子之抗性。此等植物之典型製法為取自交系之雄不稔性親本(雜交母本)與另一種自交系雄稔性親本(雜交父本)雜交。雜交種子典型地係自雄不稔性植物收成，然後售出給種植者。雄不稔性植物有時候(例如：玉米)可藉由割頂製得，亦即以機械去除雄性繁殖器官(或雄花)，但更常作法為以植物基因組中之基因決定子造成雄不稔。此時且尤其當需要自雜交植物收成種子作為所需產物時，通常適用之作法為確保包含負責雄不稔性之基因決定子之雜交植物完全恢復雄稔性。其作法為確保父本具有適當稔性恢復基因，可使包含負責雄不稔性之基因決定子之雜交植物恢復雄稔性。雄不稔性之基因決定子可位在細胞質中。細胞質雄不稔性(CMS)實例說明於例如：萵苣(*Brassica*)屬種。然而，雄不稔性之基因決定子亦可位在細胞核基因組中。雄不稔性植物亦可採用植物生物技術方法取得，如：遺傳工程法。取得雄不稔性植物之特別適用方法說明於 WO 89/10396，其中例如：使核糖核酸酶，如：芽孢桿菌 RNA 酶(barnase)選擇性表現在雄蕊之孢子囊膜細胞中。藉由核糖核酸酶抑制劑(如：barstar)在孢子囊膜細胞中之表現即可恢復稔性。

可根據本發明處理之植物或植物栽培品種(可由植物生物技術方法，如：遺傳工程法得到)可為除草劑耐受性植物，亦即可以耐受一種或多種特定除草劑之植物。此等植物可採用基因轉化法或選拔包含賦與此等除草劑耐受性之突變之植物取得。

除草劑耐受性植物為例如：嘉磷塞(glyphosate)耐受性植物，亦即可以耐受除草劑嘉磷塞或其鹽之植物。植物可以透過許多不同方法來耐受嘉磷塞。例如：嘉磷塞耐受性植物可藉由編碼酵素 5-烯醇丙酮醯基莽草酸-3-磷

酸酯合成酶(EPSPS)之基因轉化植物後形成。此等 EPSPS 基因實例為沙門氏菌(*Salmonella typhimurium*)細菌之 AroA 基因(突變株 CT7) (Comai 等人之 1983, Science, 221, 370-371)、農桿菌屬(*Agrobacterium sp.*)細菌之 CP4 基因 (Barry 等人之 1992, Curr. Topics Plant Physiol. 7, 139-145)、編碼矮牽牛 EPSPS (Shah 等人之 1986, Science 233, 478-481)、番茄 EPSPS (Gasser 等人之 1988, J. Biol. Chem. 263, 4280-4289)或 Eleusine EPSPS (WO 01/66704)之基因。其亦可為突變之 EPSPS。嘉磷塞-耐受性植物亦可藉由表現編碼嘉磷塞氧化還原酶酵素之基因製得。嘉磷塞耐受性植物亦可藉由表現編碼嘉磷塞乙醯基轉移酶酵素之基因製得。嘉磷塞耐受性植物亦可藉由選拔包含上述基因之天然突變之植物製得。表現賦與嘉磷塞耐受性之 EPSPS 基因之植物已有說明。表現賦與嘉磷塞耐受性之其他基因(如：脫羧基化酶基因)之植物已有說明。

其他除草劑抗性植物為例如：可以耐受會抑制酵素麩胺醯胺合成酶之除草劑，如：雙丙胺磷(bialaphos)、草銨磷(phosphinotricin)或固殺草(glufosinate)之植物。此等植物製法為藉由表現脫除除草劑毒性之酵素或可抗拒該抑制作用之突變麩胺醯胺合成酶酵素而製得。其中一種有效脫除毒性之酵素為例如：編碼草銨磷乙醯基轉化酶之酵素(如：來自鏈黴菌(*Streptomyces*)屬種)之 bar 或 pat 蛋白質)。表現外源性草銨磷乙醯基轉化酶之植物已有說明。

其他除草劑耐受性植物亦為可以耐受會抑制羥基苯基丙酮酸二氧化碳酶(HPPD)酵素之除草劑之植物。羥基苯基丙酮酸二氧化碳酶為催化對羥基苯基丙酮酸酯(HPP)轉化成黑尿酸酯之酵素。耐受 HPPD-抑制劑之植物可利用編碼天然抗性 HPPD 酵素之基因或編碼突變或嵌合之 HPPD 酵素之基因而轉化，如說明於 WO 96/38567、WO 99/24585、WO 99/24586、WO 2009/144079、WO 2002/046387 或 US 6,768,044。對 HPPD-抑制劑之耐受性亦可藉由編碼某些酵素之基因來轉化植物後取得，使其儘管在 HPPD-抑制劑抑制天然

HPPD 酵素下仍可形成黑尿酸酯。此等植物與基因說明於 WO 99/034008 與 WO 02/36787。植物對 HPPD 抑制劑之耐受性除了藉由編碼 HPPD-耐受性酵素之基因外，亦可藉由編碼具有預苯酸鹽脫氫酶酵素之基因來轉化植物而改善，如：說明於 WO 2004/024928。此外，可藉由嵌插編碼可以代謝或降解 HPPD 抑制劑之酵素(如：CYP450 酵素)之基因至植物之基因組中，使該等植物更耐受 HPPD-抑制劑除草劑(參見 WO 2007/103567 及 WO 2008/150473)。

其他除草劑耐受性植物亦指可以耐受乙醯基乳酸鹽合成酶(ALS)抑制劑之植物。已知之 ALS-抑制劑包括例如：磺醯基脲類、咪唑啉酮類、三唑并嘧啶類、嘧啶基氧(硫)苯甲酸酯類與/或磺醯基胺基羰基三唑啉酮類除草劑。已知 ALS 酵素(亦稱為乙醯基羧基酸合成酶，AHAS)之不同突變可賦與對不同除草劑及除草劑種類之耐受性，如說明於例如：Tranel 與 Wright(*Weed Science* 2002, 50, 700-712)。磺醯基脲類耐受性植物與咪唑啉酮類耐受性植物之製法已有說明。其他耐受磺醯基脲類與咪唑啉酮類之植物亦已有說明。

其他耐受咪唑啉酮類與/或磺醯基脲類之植物製法包括誘變法、在含有除草劑之細胞培養物中選拔、或突變育種法(例如：大豆可參見 US 5,084,082，稻可參見 WO 1997/41218，製糖用甜菜可參見 US 5,773,702 與 WO 1999/057965，萵苣可參見 US 5,198,599 或葵花可參見 WO 01/065922)。

亦可根據本發明處理之植物或植物栽培品種(由植物生物技術方法，如：遺傳工程法製得者)為昆蟲抗性轉殖基因植物，亦即有抗性對抗某些標靶昆蟲侵害之植物。此等植物可利用基因轉化法，或選拔包含賦與此等昆蟲抗性之突變之植物而得到。

本文所採用"昆蟲-抗性轉殖基因植物"包括任何包含至少一種轉殖基因之植物，其中包含編碼下列之序列：

1)來自蘇雲金芽孢桿菌之殺昆蟲結晶蛋白質或其殺昆蟲部份，如：列於

Crickmore 等人之 Microbiology and Molecular Biology Reviews 1998, 62, 807-813, 由 Crickmore 等人(2005)更新之蘇雲金芽孢桿菌毒素命名法(連線至：http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/)之殺昆蟲結晶蛋白質，或其殺昆蟲部份，例如：Cry 蛋白質類 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1B、Cry1C、Cry1D、Cry1F、Cry2Ab、Cry3Aa、或 Cry3Bb 或其殺昆蟲部份之蛋白質(例如：EP-A 1999141 及 WO 2007/107302)，或彼等由例如：美國專利申請案 12/249,016 中所說明之合成性基因編碼之蛋白質；或

2) 來自蘇雲金芽孢桿菌之結晶蛋白質或其一部份，其在不同於蘇雲金芽孢桿菌之第二種其他結晶蛋白質或其一部份之存在下具有殺昆蟲性，如：由 Cy34 與 Cy35 結晶蛋白質組成之二元毒素(Nat. Biotechnol. 2001, 19, 668-72; Applied Environm. Microbiol. 2006, 71, 1765-1774)；或由 Cry1A 或 Cry1F 蛋白質與 Cry2Aa 或 Cry2Ab 或 Cry2Ae 蛋白質組成之二元毒素(美國專利申請案 12/214,022 及 EP08010791.5)；或

3) 包含來自蘇雲金芽孢桿菌之兩種不同殺昆蟲結晶蛋白質之一部份之雜化殺昆蟲蛋白質，如：上述 1)之雜化蛋白質或上述 2)之雜化蛋白質，例如：由玉米品項 MON98034 產生之 Cry1A.105 蛋白質(WO 2007/027777)；或

4) 上述 1)至 3)中任一蛋白質，其中有些(特定言之 1 至 10 個)胺基酸已被另一個胺基酸置換，可對標靶昆蟲屬種產生更高殺昆蟲活性且/或可擴大受影響之標靶昆蟲屬種範圍與/或由於已在選殖或轉化期間，將變化引入編碼之 DNA 中，如：玉米品項 MON863 或 MON88017 之 Cry3Bb1 蛋白質，或玉米品項 MIR604 之 Cry3A 蛋白質；或

5) 來自蘇雲金芽孢桿菌或蠟質芽孢桿菌(*Bacillus cereus*)之殺昆蟲性分泌蛋白質，或其殺昆蟲部份，如：有營養性生長力之殺昆蟲(VIP)蛋白質，其列於：http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html，例如：來自 VIP3Aa 蛋白質類之蛋白質；或

6)來自蘇雲金芽孢桿菌或蠟質芽孢桿菌之分泌蛋白質，其在來自蘇雲金芽孢桿菌或蠟質芽孢桿菌之第二分泌蛋白質之存在下具有殺昆蟲性，如：由

VIP1A 與 VIP2A 蛋白質組成之二元毒素(WO 94/21795)；或

7) 包含來自蘇雲金芽孢桿菌或蠟質芽孢桿菌之不同分泌蛋白質之一部份之雜化殺昆蟲性蛋白質，如：上述 1)之雜化蛋白質或上述 2)之雜化蛋白質；或

8) 上述 5)至 7)中任一蛋白質，其中有些(特定言之 1 至 10 個)胺基酸已被另一個胺基酸置換，可對標靶昆蟲屬種產生更高殺昆蟲活性且/或可擴大受影響之標靶昆蟲屬種範圍與/或在選殖或轉化期間，將變化引入編碼之 DNA 中(同時仍可編碼殺昆蟲性蛋白質)，如：棉花品項 COT102 之 VIP3Aa 蛋白質；或

9) 來自蘇雲金芽孢桿菌或蠟質芽孢桿菌之分泌蛋白質，其在來自蘇雲金芽孢桿菌之結晶蛋白質之存在下具有殺昆蟲性，如：由 VIP3 與 Cry1A 或 Cry1F 組成之二元毒素(美國專利申請案 61/126083 及 61/195019)，或由 VIP3 蛋白質與 Cry2Aa 或 Cry2Ab 或 Cry2Ae 蛋白質組成之二元毒素(美國專利申請案 12/214,022 及 EP 08010791.5)；

10) 如上述 9)之蛋白質，其中有些(特定言之 1 至 10 個)胺基酸已被另一個胺基酸置換，可對標靶昆蟲屬種產生更高殺昆蟲活性，及/或擴大所靶向昆蟲品種之範圍，及/或在選殖或轉化期間將變化引入編碼之 DNA 中(但仍可編碼殺昆蟲性蛋白質)。

本文所採用昆蟲抗性轉殖基因植物當然亦包括任何包含編碼上述 1 至 10 類任一種蛋白質之基因組合之植物。一項具體實施例中，昆蟲抗性植物包含超過一種編碼上述 1 至 10 類任一種蛋白質之轉殖基因，藉由使用對相同標靶昆蟲屬種具有殺昆蟲性，但卻具有不同作用模式，如：與昆蟲中不同受體結合位置結合之不同蛋白質時，可以擴大所影響之標靶昆蟲屬種範圍，或延緩昆蟲對植物發展出抗性。

本文所採用“昆蟲抗性轉殖基因植物”進一步包括任何包含至少一種轉殖基因之植物，當被害蟲攝食時，該轉殖基因所包含之序列所產生之雙股

RNA 會阻止此害蟲生長。

亦可根據本發明處理之植物或植物栽培品種(由植物生物技術方法，如：遺傳工程法製得者)可耐受非生物性逆境壓力因子。此等植物可藉由基因轉化法或選拔包含賦與此等逆境壓力抗性突變之植物而得。特別有用之逆境壓力耐受性植物包括下列：

- a. 包含可以降低聚(ADP-核糖)聚合酶(PARP)基因在植物細胞或植物中之表現與/或活性之轉殖基因之植物；
- b. 包含可以降低植物或植物細胞之 PARG 編碼基因之表現與/或活性之加強逆境壓力耐受性轉殖基因之植物；
- c. 包含編碼菸鹼胺腺嘌呤二核苷酸回收生合成途徑之植物功能性酵素(包括菸鹼胺酶、菸酸酯核糖磷酸轉化酶、菸酸單核苷酸腺嘌呤基轉化酶、菸鹼胺腺嘌呤二核苷酸合成酶或菸鹼胺核糖磷酸轉化酶)之加強逆境壓力耐受性轉殖基因之植物。

亦可根據本發明處理之植物或植物栽培品種(由植物生物技術方法，如：遺傳工程法製得者)可改變所採收產品之產量、品質與/或儲存安定性且/或改變所採收產品之特定成份之性質，如：

- 1) 合成改質澱粉之轉殖基因植物，其相較於野生種植物細胞或植物所合成澱粉，已在物化特性上，特定言之，直鏈澱粉含量或直鏈澱粉/分支鏈澱粉比例、分支程度、平均鏈長、側鏈分佈、黏性表現、膠凝強度、澱粉粒大小與/或澱粉粒形態等方面均已改變，因此使此改質澱粉更適於某些用途。
- 2) 合成非澱粉碳水化合物聚合物或合成相較於未經基因改造之野生型植物具有改變之性質之非澱粉碳水化合物聚合物之轉殖基因植物。其實例為產生聚果糖(尤指菊糖型與果聚糖型)之植物、產生 α -1,4 葡聚糖之植物、產生 α -1,6 分支 α -1,4 葡聚糖之植物、及產生艾南聚醣(alternan)之植物。
- 3) 產生玻尿酸(hyaluronan)之轉殖基因植物。
- 4) 具有特別性質之轉殖基因植物或雜交植物如：‘高可溶性固形物含量’、‘低辛辣味’(LP)與/或‘長儲存期’(LS)之洋蔥。

亦可根據本發明處理之植物或植物栽培品種(由植物生物技術方法,如:遺傳工程法製得者)為如:已改變纖維特性之棉花植物之植物。此等植物可藉由基因轉化法或選拔包含賦與此等改變之纖維特性之突變之植物取得,其包括:

- a)包含改變之纖維素合成酶基因型式之植物,如:棉花植物;
- b)包含改變之 *rsw2* 或 *rsw3* 同系核酸型式之植物,如:棉花植物,如:提高蔗糖磷酸合成酶表現之棉花植物;
- c)已提高蔗糖磷酸合成酶表現之植物,如:棉花植物;
- d)其中纖維細胞基部之胞間連絲閘門開關時間已透過例如:向下調節纖維選擇性 β -1,3-葡聚糖酶而改變之植物,如:棉花植物;
- e)具有已透過例如:N-乙醯基葡糖胺轉化酶基因(包括 *nodC*)與幾丁質合成酶基因之表現而改變反應性之纖維之植物,如:棉花植物。

亦可根據本發明處理之植物或植物栽培品種(由植物生物技術方法,如:遺傳工程法製得者)為已改變油含量特性之植物,如:油菜或相關之藝苔類(*Brassica*)植物。此等植物可藉由基因轉化法或選拔包含已賦與此等改變之油特性之突變之植物,其包括:

- a)可產生高油酸含量之油之植物,如:油菜植物,
- b)可產生低亞麻酸含量之油之植物,如:油菜植物,
- c)可產生低飽和脂肪酸含量之油之植物,如:油菜植物。

亦可根據本發明處理之植物或植物栽培品種(由植物生物技術方法,如:遺傳工程法製得者)為下列植物,如:對例如:馬鈴薯病毒 Y 具病毒抗性之馬鈴薯(來自阿根廷 *Tecnoplant* 之 SY230 及 SY233 品項),或對如:馬鈴薯晚疫病具病害抗性之馬鈴薯(例如:RB 基因),或降低低溫所誘發甜度之馬鈴薯(其帶有基因 *Nt-Inh*, *II-INV*)或具有矮種表型之馬鈴薯(A-20 氧化酶基因)。

亦可根據本發明處理之植物或植物栽培品種(由植物生物技術方法,如:

遺傳工程法製得者)為已改變種子裂莢特性之植物，如：油菜或相關之蕓苔類植物。此等植物可採用基因轉化法或選拔包含賦與此等改變特性之突變之植物取得，且包括如：改變或減少種子裂莢之油菜。

可根據本發明處理之特別適用之轉殖基因植物為包含轉化品項之植物或包含轉化品項組合之植物，其在美國係美國農業部(USDA)的動物及植物健康檢測局(Animal and Plant Health Inspection Service(APHIS))已核准或仍未決中之非管制狀態的申請標的。此資訊隨時可自 APHIS(4700 River Road, Riverdale, MD 20737, USA) 取得，例如：得自其網站 http://www.aphis.usda.gov/brs/not_reg.html。在本申請案之申請日，向 APHIS 申請中或已由 APHIS 核准之申請案包括下列資訊：

- 申請案：申請案之案號。有關轉化品項之技術說明可參見從 APHIS 網站依據此申請案案號取得之個別申請案文件。此等說明內容已以引用之方式併入本文中。
- 展延申請案：係指要求展延範圍或名詞之先前申請案。
- 機構：提出申請案之機構名稱。
- 管制物品：相關之植物品種。
- 轉殖基因表型：利用轉化品項賦與植物之性狀。
- 轉化品項或品系：要求非管制狀態之一或多種品項之名稱(有時候亦稱為品系)。
- APHIS 文獻：與申請案相關之由 APHIS 所公開之各種不同文獻及 APHIS 要求之文獻。

可根據本發明處理之特別適用之轉殖基因植物為包含一種或多種編碼一種或多種毒素之基因之植物，係以下列商品名稱出售之轉殖基因植物：YIELD GARD® (例如：玉米、棉花、大豆)、KnockOut® (例如：玉米)、BiteGard® (例如：玉米)、BT-Xtra® (例如：玉米)、StarLink® (例如：玉米)、Bollgard® (棉花)、Nucotn® (棉花)、Nucotn 33B® (棉花)、NatureGard® (例如：玉米)、Protecta®及 NewLeaf® (馬鈴薯)。可述及之除草劑耐受性植物

實例為以下列名稱出售之玉米栽培品種、棉花栽培品種與大豆栽培品種：Roundup Ready® (耐受嘉磷塞，例如：玉米、棉花、大豆)、Liberty Link® (耐受草銨磷(phosphinotricin)，例如：油菜)、IMI® (耐受咪唑啉酮)及 SCS® (耐受磺酰脲，例如：玉米)。

可述及之除草劑抗性植物(依傳統方式育種之除草劑耐受性植物)包括以名稱 Clearfield®出售之栽培品種(例如：玉米)。

可根據本發明處理之特別適用之轉殖基因植物為包含轉化品項或轉化品項組合之植物，其列於例如：各種不同國家或地方管理局之資料庫(參見例如：[http : //gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx](http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx) 及 [http : //cera-gmc.org/index.php?evidcode=&hstIDXCode=&gType=&AbbrCode=&atCode=&stCode=&coIDCode=&action=gm_crop_database&mode=Submit](http://cera-gmc.org/index.php?evidcode=&hstIDXCode=&gType=&AbbrCode=&atCode=&stCode=&coIDCode=&action=gm_crop_database&mode=Submit))。

本發明活性成份或組成物亦可用於保護材料，保護工業材料，對抗不要之微生物(例如：真菌與昆蟲)之侵害與破壞。

此外，本發明組成物可單獨使用或與其他活性成份組合，作為抗污塞組成物使用。

咸了解，本文所指之工業材料為用於工業之無生命材料。例如：可使用本發明活性成份保護免於微生物改變或破壞之工業材料可為膠黏劑、膠水、紙張、壁紙與紙板、紡織品、地毯、皮革、木料、塗料與塑膠製品、冷卻潤滑劑及其他可能被微生物感染或破壞之材料。可以保護之材料範圍內亦包括可能被微生物繁殖所破壞之製造廠與建築之一部份，例如：冷卻水循環、冷卻與加熱系統、及通風與空調系統。本發明範圍內之工業材料較佳係包括膠黏劑、膠水、紙張與紙板、皮革、木料、塗料、冷卻潤滑劑與導熱流體，更佳係木料。本發明活性成份或組成物可預防不良效應，如：腐爛、分解、變色、脫色、或長霉。此外，本發明組成物可用於保護與鹽水或有鹹味的水接觸之物體，尤指：船體、隔板、編網、建築物、繫船設備及訊號系統，防止污塞。

本發明控制不要之真菌之方法亦可用於保護庫存貨物。咸了解庫存貨物係指需要長期保護之天然植物性或動物性物質或其加工產品。植物性庫存貨物為例如：植物或植物植株，如：莖、葉、塊莖、種子、果實、穀粒，其可在新鮮採收時保護或在(預先)乾燥、潤濕、粉碎、研磨、壓縮、或焙燒加工之後加以保護。庫存貨物亦包括木材，不論是否經過加工，如：建築木材、電線桿與圍籬，或呈最終產品形式，如：傢俱。動物性庫存貨物為例如：獸皮、皮革、皮草與毛。本發明活性成份可預防不良效應，如：腐爛、分解、變色、脫色、或長霉。

可根據本發明處理之真菌病害之病原菌之非限制性實例包括：

由白粉病病原菌引起之病害，例如：白粉菌屬(*Blumeria species*)，例如：禾白粉菌(*Blumeria graminis*)；白澀病菌屬(*Podosphaera species*)，例如：蘋果白澀病菌(*Podosphaera leucotricha*)；單絲殼屬(*Sphaerotheca species*)，例如：蒼耳單絲殼(*Sphaerotheca fuliginea*)；鉤絲殼屬(*Uncinula species*)，例如：葡萄鉤絲殼(*Uncinula necator*)；由銹病病原菌引起之病害，例如：膠銹菌屬(*Gymnosporangium species*)，例如：梨膠銹菌(*Gymnosporangium sabinae*)；駝孢銹菌屬(*Hemileia species*)，例如：駝孢銹病菌(*Hemileia vastatrix*)；層銹菌屬(*Phakopsora species*)，例如：山馬蝗層銹菌(*Phakopsora pachyrhizi*)與豆薯層銹菌(*Phakopsora meibomia*)；柄銹菌屬(*Puccinia species*)，例如：隱匿柄銹菌(*Puccinia recondite*)或小麥柄銹菌(*Puccinia triticina*)；單胞銹菌屬(*Uromyces species*)，例如：豆單胞銹菌(*Uromyces appendiculatus*)；由卵菌(*Oomycetes*)病原菌引起之病害，例如：單軸黴屬(*Bremia species*)，例如：萵苣單軸黴(*Bremia lactucae*)；霜黴屬(*Peronospora species*)，例如：豌豆霜黴(*Peronospora pisi*)或蕓苔霜黴(*P. brassicae*)；疫黴屬(*Phytophthora species*)，例如：致病疫黴(*Phytophthora infestans*)；單軸黴屬(*Plasmopara species*)，例如：葡萄單軸黴(*Plasmopara viticola*)；假霜黴屬(*Pseudoperonospora species*)，例如：啤酒花藤假霜黴(*Pseudoperonospora humuli*)或瓜類假霜黴

(*Pseudoperonospora cubensis*)；腐黴屬(*Pythium species*)，例如：終極腐黴(*Pythium ultimum*)；由例如：下列病菌引起之葉斑病與葉枯病：鏈格孢屬(*Alternaria species*)，例如：早疫鏈格孢(*Alternaria solani*)；尾孢菌屬(*Cercospora species*)，例如：菠菜尾孢菌(*Cercospora beticola*)；鐮孢菌屬(*Cladosporium species*)，例如：胡瓜鐮孢菌(*Cladosporium cucumerinum*)；旋孢腔菌屬(*Cochliobolus species*)，例如：禾旋孢腔菌(*Cochliobolus sativus*(分生孢子型：德雷克斯蠕孢(*Drechslera*)，同義字：長蠕孢(*Helminthosporium*))；炭疽菌屬(*Colletotrichum species*)，例如：菜豆炭疽菌(*Colletotrichum lindemuthianum*)；孔雀斑菌屬(*Cycloconium species*)，例如：油橄欖孔雀斑菌(*Cycloconium oleaginum*)；間座殼菌屬(*Diaporthe species*)，例如：柑桔間座殼菌(*Diaporthe citri*)；囊腔菌屬(*Elsinoe species*)，例如：茄囊腔菌(*Elsinoe fawcettii*)；盤長孢菌屬(*Gloeosporium species*)，例如：桃炭疽病盤長孢菌(*Gloeosporium laeticolor*)；菊炭疽菌屬(*Glomerella species*)，例如：繡線菊炭疽菌(*Glomerella cingulata*)；球座菌屬(*Guignardia species*)，例如：葡萄球座菌(*Guignardia bidwelli*)；殼小球腔菌屬(*Leptosphaeria species*)，例如：油菜殼小球腔菌(*Leptosphaeria maculans*)；瘟黴菌屬(*Magnaporthe species*)，例如：稻瘟黴菌(*Magnaporthe grisea*)；球腔菌屬(*Microdochium species*)，例如：雪黴球腔菌(*Microdochium nivale*)；小球殼菌屬(*Mycosphaerella species*)，例如：禾生小球殼菌(*Mycosphaerella graminicola*)與斐濟小球殼菌(*M. fijiensis*)；葉炫菌屬(*Phaeosphaeria species*)，例如：小麥葉炫菌(*Phaeosphaeria nodorum*)；核腔菌屬(*Pyrenophora species*)，例如：大麥核腔菌(*Pyrenophora teres*)；柱隔孢屬(*Ramularia species*)，例如：大麥柱隔孢(*Ramularia collo-cygni*)；喙孢屬(*Rhynchosporium species*)，例如：黑麥喙孢(*Rhynchosporium secalis*)；殼針孢屬(*Septoria species*)，例如：芹菜殼針孢(*Septoria apii*)；雪黴屬(*Typhula species*)，例如：麥類雪腐褐色小粒菌核病菌(*Typhula incarnate*)；黑星病菌屬(*Venturia species*)，例如：蘋果黑星病菌(*Venturia inaequalis*)；由例如：下

列病菌引起之根-與莖病害：伏革菌屬(*Corticium* species)，例如：禾伏革菌(*Corticium graminearum*)；鐮孢菌屬(*Fusarium* species)，例如：尖鐮孢菌(*Fusarium oxysporum*)；頂囊殼菌屬(*Gaeumannomyces* species)，例如：禾頂囊殼菌(*Gaeumannomyces graminis*)；絲核菌屬(*Rhizoctonia* species)，如，例如：茄絲核菌(*Rhizoctonia solani*)；黑粉菌屬(*Tapesia* species)，例如：針形黑粉菌(*Tapesia aciformis*)；根腐病菌屬(*Thielaviopsis* species)，例如：菸草根腐病菌(*Thielaviopsis basicola*)；由例如：下列病菌引起之穗與花序(包括玉米軸)病害，如：鏈格孢屬(*Alternaria* species)，例如：鏈格孢屬(*Alternaria* spp.)；麴菌屬(*Aspergillus* species)，例如：黃麴菌(*Aspergillus flavus*)；枝孢屬(*Cladosporium* species)，例如：芽枝狀枝孢(*Cladosporium cladosporioides*)；麥角菌屬(*Claviceps* species)，例如：紫色麥角菌(*Claviceps purpurea*)；鐮孢菌屬(*Fusarium* species)，例如：大刀鐮孢菌(*Fusarium culmorum*)；赤黴屬(*Gibberella* species)，例如：玉蜀黍赤黴(*Gibberella zeae*)；雪黴葉枯菌屬(*Monographella* species)，例如：小麥雪黴葉枯病菌(*Monographella nivalis*)；腐朽菌屬(*Septoria* species)，例如：小麥腐朽病菌(*Septoria nodorum*)；由例如：下列病菌引起之黑穗病：黑穗菌屬(*Sphacelotheca* species)，例如：玉米絲黑穗病菌(*Sphacelotheca reiliana*)；網腥黑穗病菌屬(*Tilletia* species)，例如：小麥網腥黑穗病菌(*Tilletia caries*)、小麥矮腥黑穗病菌(*T. controversa*)；稈黑穗病菌屬(*Urocystis* species)，例如：黑麥稈黑穗病菌(*Urocystis occulta*)；裸黑穗病菌屬(*Ustilago* species)，例如：大麥裸黑穗病菌(*Ustilago nuda*)、小麥裸黑穗病菌(*U. nuda tritici*)；由例如：下列病菌引起之果實腐爛病：麴菌屬(*Aspergillus* species)，例如：黃麴菌(*Aspergillus flavus*)；灰黴屬(*Botrytis* species)，例如：灰黴菌(*Botrytis cinerea*)；青黴屬(*Penicillium* species)，例如：擴展青黴(*Penicillium expansum*)與紫青黴(*P. purpurogenum*)；核盤菌屬(*Sclerotinia* species)，例如：核盤黴莖腐菌(*Sclerotinia sclerotiorum*)；輪枝菌屬(*Verticillium* species)，例如：黃萎輪枝菌(*Verticillium albo-atrum*)；由例如：

下列病菌引起之種子與土壤源性腐爛與猝倒病，及幼苗之病害：由鐮孢菌屬(*Fusarium species*)引起，例如：大刀鐮孢菌(*Fusarium culmorum*)；疫黴屬(*Phytophthora species*)，例如：惡疫黴(*Phytophthora cactorum*)；腐黴屬(*Pythium species*)，例如：終極腐黴(*Pythium ultimum*)；絲核菌屬(*Rhizoctonia species*)，例如：茄絲核菌(*Rhizoctonia solani*)；白絹病菌屬(*Sclerotium species*)，例如：白絹病菌(*Sclerotium rolfsii*)；由例如：叢赤殼菌屬(*Nectria species*)，例如：仁果幹癌叢赤殼菌(*Nectria galligena*)引起之腐爛病、簇葉病與枯梢病：由例如：腐核盤菌屬(*Monilinia species*)，例如：桃褐腐核盤菌(*Monilinia laxa*)引起之疫病；由例如：外囊菌屬(*Taphrina species*)，例如：畸形外囊菌(*Taphrina deformans*)引起之葉、花、果實變形；由例如：下列病菌引起之木本植物萎凋病：由絲孢(*Phaemoniella clamydospora* 與 *Phaeoacremonium aleophilum*)與地中海孢孔菌(*Fomitiporia mediterranea*)引起之埃斯卡病(Esca disease)；由例如：灰黴屬(*Botrytis species*)，例如：灰黴菌(*Botrytis cinerea*)引起之花與種子病害；由例如：下列病菌引起之植物塊莖病害：絲核菌屬(*Rhizoctonia species*)，例如：茄絲核菌(*Rhizoctonia solani*)；長蠕孢屬(*Helminthosporium species*)，例如：茄長蠕孢(*Helminthosporium solani*)；由細菌病原菌引起之病害，例如：白葉枯病菌屬(*Xanthomonas species*)，例如：稻白葉枯病菌(*Xanthomonas campestris* pv. *Oryzae*)；假單孢菌屬(*Pseudomonas species*)，例如：甜瓜細菌性葉斑病菌(*Pseudomonas syringae* pv. *Lachrymans*)；歐文氏菌屬(*Erwinia species*)，例如：解澱粉歐文氏菌(*Erwinia amylovora*)。

較佳係控制下列大豆病害：

由例如：下列病菌引起之葉部、莖部、莢與種子之真菌病害：鏈格孢葉斑病(鏈格孢(*Alternaria spec. atrans tenuissima*))、炭疽病(炭疽菌(*Colletotrichum gloeosporoides dematium* var. *truncatum*))、褐斑病(大豆殼針孢(*Septoria glycines*))、尾孢菌葉斑病與褐斑病(菊池尾孢菌(*Cercospora*

kikuchii)、筭黴葉斑病(筭黴(*Choanephora infundibulifera trispora*)(同義字))、節叢孢葉斑病(大豆節叢孢(*Dactuliophora glycines*))、霜黴病(大豆霜黴(*Peronospora manshurica*))、德雷克斯蠕孢葉枯病(大豆德雷克斯蠕孢(*Drechslera glycini*))、蛙眼葉斑病(大豆尾孢菌(*Cercospora sojae*))、小光殼葉斑病(三葉草小光殼(*Leptosphaerulina trifolii*))、葉點黴葉斑病(大豆葉點黴(*Phyllosticta sojaecola*))、莢與莖葉枯病(大豆擬莖點黴(*Phomopsis sojae*))、粉黴病(蓼白粉菌(*Microsphaera diffusa*))、鬚殼黴葉斑病(大豆鬚殼黴(*Pyrenochaeta glycines*))、絲核菌氣生部、葉部與蛛絲病(茄絲核菌(*Rhizoctonia solani*))、銹病(山馬蝗層銹菌(*Phakopsora pachyrhizi*))、豆薯層銹菌(*Phakopsora meibomia*))、痂病(大豆痂圓孢(*Sphaceloma glycines*))、黑腐病(蔥葉枯病菌(*Stemphylium botryosum*))、葉斑病(山扁豆生棒孢黴(*Corynespora cassiicola*))。

由例如：下列病菌引起之根與莖部之真菌病害：黑根腐病(叢赤殼(*Calonectria crotalariae*))、炭腐病(菜豆立炫菌(*Macrophomina phaseolina*))、鐮孢菌葉枯病或萎凋病、根腐病、及莢與頸腐病(尖鐮孢菌(*Fusarium oxysporum*))、直喙鐮孢菌(*Fusarium orthoceras*)、半裸鐮孢菌(*Fusarium semitectum*)、木賊鐮孢菌(*Fusarium equiseti*))、鏈孢黴根腐病(鏈孢黴(*Mycleptodiscus terrestris*))、新赤殼菌病(脈新赤殼菌(*Neocosmopora vasinfecta*))、莢與莖枯病(大豆南方間座殼菌(*Diaporthe phaseolorum*))、莖潰瘍病(大豆莖幹潰瘍間座殼菌(*Diaporthe phaseolorum var. caulivora*))、疫黴根腐病(大豆疫黴(*Phytophthora megasperma*))、褐莖腐病(大豆莖點黴(*Phialophora gregata*))、腐黴病(胡瓜腐黴(*Pythium aphanidermatum*))、不規則腐黴(*Pythium irregulare*)、德巴利腐黴(*Pythium debaryanum*)、薑軟腐黴(*Pythium myriotylum*)、終極腐黴(*Pythium ultimum*))、絲核菌根腐病、莖萎病與猝倒病(茄絲核菌(*Rhizoctonia solani*))、核盤黴莖腐病(核盤黴莖腐菌(*Sclerotinia sclerotiorum*))、核盤黴南方葉枯病(核盤黴白絹病菌(*Sclerotinia*

rolfsii)、串株黴根腐病(基生根串株黴(*Thielaviopsis basicola*))。

會分解或破壞工業材料之微生物包括例如：細菌、真菌、酵母菌、藻類與黏狀生物體。本發明活性成份較佳作用係對抗真菌，尤指霉菌、使木料變色及破壞木料之真菌(擔子菌(*Basidiomycetes*))，及對抗黏狀生物體與藻類。其實例包括下列屬種之微生物：鏈格孢(*Alternaria*)，如：細鏈格孢(*Alternaria tenuis*)；麴菌(*Aspergillus*)，如：黑麴菌(*Aspergillus niger*)；毛殼菌(*Chaetomium*)，如：球毛殼菌(*Chaetomium globosum*)；粉孢革菌(*Coniophora*)，如：彩絨革蓋菌(*Coniophora puetana*)；香菇(*Lentinus*)，如：虎皮香菇(*Lentinus tigrinus*)；青黴(*Penicillium*)，如：灰綠青黴(*Penicillium glaucum*)；多孔菌(*Polyporus*)，如：染色雲芝(*Polyporus versicolor*)；短梗黴(*Aureobasidium*)，如：出芽短梗黴(*Aureobasidium pullulans*)；核莖點黴(*Sclerophoma*)，如：核莖點黴(*Sclerophoma pityophila*)；木黴(*Trichoderma*)，如：綠色木黴(*Trichoderma viride*)；埃希氏菌屬(*Escherichia*)，如：大腸桿菌(*Escherichia coli*)；假單胞菌(*Pseudomonas*)，如：銅綠假單胞菌(*Pseudomonas aeruginosa*)；葡萄球菌(*Staphylococcus*)，如：金黃色葡萄球菌(*Staphylococcus aureus*)。

此外，本發明化合物亦具有良好抗黴菌活性。其具有極廣泛之抗黴菌活性範圍，尤其對抗皮癬菌與酵母菌、霉菌與雙相真菌(例如：對抗念珠菌屬(*Candida species*)，如：白色念珠菌屬(*Candida albicans*)、念珠菌(*Candida glabrata*))、與絮狀表皮癬菌(*Epidermophyton floccosum*)；麴菌(*Aspergillus*)屬，如：黑麴菌(*Aspergillus niger*)與煙麴菌(*Aspergillus fumigatus*)；毛癬菌屬(*Trichophyton species*)，如：鬚髮癬菌(*Trichophyton mentagrophytes*)；小芽胞癬菌屬(*Microsporon species*)，如：犬小芽胞癬菌(*Microsporon canis*)與奧杜盎小芽胞癬菌(*Microsporon audouinii*)。此等真菌列表絕未限制所控制黴菌之涵蓋範圍，且僅供舉例說明。

本發明活性成份因此可用於醫學及非醫學用途中。

當本發明活性成份作為殺真菌劑使用時，其施用率可在相當大範圍內變化，依施用型態而異。本發明活性成份之施用率為

- 植物植株(例如:葉部)處理法:0.1 至 10 000 g/ha,較佳係 10 至 1000 g/ha,更佳係 50 至 300 g/ha(若採用澆水或滴注施用法時,甚至可能降低施用率,尤其當使用惰性基質(如:使用岩棉或珍珠石)時;
- 種子處理法:每 100 kg 種子施用 2 至 200 g,較佳係每 100 kg 種子施用 3 至 150 g,更佳係每 100 kg 種子施用 2.5 至 25 g,甚至更佳係每 100 kg 種子施用 2.5 至 12.5 g;
- 土壤處理法:0.1 至 10 000 g/ha,較佳係 1 至 5000 g/ha。

此等施用率僅供舉例說明,並未限制本發明之目的。

本發明活性成份或組成物因此可在處理之後用於保護植物一段時間,免於上述病原菌侵害。該保護期一般可在活性成份處理植物之後長達 1 至 28 天,較佳係 1 至 14 天,更佳係 1 至 10 天,甚至更佳係 1 至 7 天,或在處理種子後長達 200 天。

此外,本發明處理法可減少所採收材料及其所製成食物與動物飼料中之黴菌毒素含量。黴菌毒素包括特定言之(但不限於)下列:脫氧雪腐鏽孢菌烯醇(deoxynivalenole)(DON)、雪腐鏽孢菌烯醇(nivalenole)、15-Ac-DON、3-Ac-DON、T2-與 HT2-毒素、伏馬鏽孢毒素(fumonisin)、玉米黴菌毒素(zearalenone)、串珠鏽孢菌素(moniliformin)、鏽孢菌素(fusarin)、蛇形菌素(diaceotoxyscirpenole(DAS))、白殭菌素(beauvericin)、恩鏽孢菌素(enniaticin)、層出鏽孢菌素(fusaroproliferin)、鏽孢菌烯醇素(fusarenol)、赭黴菌毒素(ochratoxins)、棒曲毒素(patulin)、麥角生物鹼與黃麴毒素,其係由例如:下列真菌所產生:鏽孢菌屬(*Fusarium spec.*),如:銳頂鏽孢菌(*Fusarium acuminatum*)、燕麥鏽孢菌(*F. avenaceum*)、克地鏽孢菌(*F. crookwellense*)、黃色鏽孢菌(*F. culmorum*)、禾穀鏽孢菌(*F. graminearum*(玉蜀黍赤黴(*Gibberella zeae*)))、木賊鏽孢菌(*F. equiseti*)、藤倉鏽孢菌(*F. fujikoroi*)、香蕉

鐮孢菌(*F. musarum*)、尖鐮孢菌(*F. oxysporum*)、層出鐮孢菌(*F. proliferatum*)、早熟禾鐮孢菌(*F. poae*)、假禾鐮孢菌(*F. pseudograminearum*)、接骨木鐮孢菌(*F. sambucinum*)、藤草鐮孢菌(*F. scirpi*)、半裸鐮孢菌(*F. semitectum*)、茄病鐮孢菌(*F. solani*)、擬枝孢鐮孢菌(*F. sporotrichoides*)、鐮孢菌(*F. langsethiae*)、鐮孢菌(*F. subglutinans*)、三線鐮孢菌(*F. tricinctum*)、擬輪生鐮孢菌(*F. verticillioides*)，等等，但亦可由麴菌屬(*Aspergillus spec.*)、青黴菌屬(*Penicillium spec.*)、麥角菌屬(*Claviceps spec.*)、葡萄穗黴屬(*Stachybotrys spec.*)，等等引起。

若適當時，本發明組成物亦可在某些濃度或施用率下，作為除草劑、安全劑、生長調節劑或改善植物性質之製劑、或作為殺微生物劑使用，例如：殺真菌劑、抗霉劑、殺細菌劑、殺病毒劑(包括對抗類病毒之製劑)或作為對抗 MLO(似黴漿菌生物體)與 RLO(似立克次體生物體)之製劑。若適當時，其亦可作為合成其他活性成份之中間物或前體使用。

【圖式簡單說明】 無

【實施方式】

下列實例詳細說明本發明。

A.化學實例

1.N-(氰基甲基)-3-(3,5-二氯苯基)-5-甲氧基-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-羧醯胺(實例 1.20-40)製法

中間物 1 : 3,5-二氯苯甲醛肟

取 23.82 g (342.8 mmol)脛基胺鹽酸鹽與 80 ml 乙醇混合。添加 28.12 g (342.8 mmol)乙酸鈉後，以 30 分鐘時間滴加含 50.00 g (285.7 mmol) 3,5-二氯苯甲醛之 100 ml 乙醇溶液，攪拌混合物 2 小時後，靜置一夜。反應混合物經過完全濃縮後，添加 500 ml CH_2Cl_2 ，使用 400 ml 水洗滌混合物。水相使

用 100 ml CH_2Cl_2 洗滌一次，取有機相經過 Na_2SO_4 脫水，過濾及濃縮。殘質未經進一步純化即使用。產量：56.50 g (98%)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) : $\sigma = 7.36$ (s, 1H, Ar-H), 7.47 (s, 2H, Ar-H), 7.63 (s br, 1H, OH), 8.02 (s, 1H, HC=NOH)。

中間物 2：3,5-二氯-N-羥基苯羧醯亞胺醯基氯

先取 30.00 g (157.9 mmol) 3,5-二氯苯甲醛肟加至 379 ml 0.5M HCl 之 DMF 溶液中，於室溫(RT)下分批添加 116.7 g (189.5 mmol) Oxone(過氧單硫酸鉀)。為了防止反應混合物升溫至內溫超過 50°C ，利用冰浴冷卻。2 小時後，取反應溶液倒至 1 升冰水中，每次使用 500 ml 醚萃取 2 次。合併之有機相再使用 400 ml 0.5M HCl 水溶液及 200 ml 飽和 NaCl 溶液洗滌，經 Na_2SO_4 脫水，過濾及濃縮。殘質未經進一步純化即使用。產量：28.40 g (80%)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) : $\sigma = 7.43$ (s, 1H, Ar-H), 7.74 (s, 2H, Ar-H), 8.03 (s br, 1H, OH)。

中間物 3：3-(3,5-二氯苯基)-5-甲氧基-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-羧酸甲酯 (實例 A-116)

取 35.00 g (155.9 mmol) 溶於 490 ml 2-丙醇，添加 31.61 g (171.5 mmol) 2-甲氧基丙烯酸甲酯。於 RT 下，添加 65.49 g (779.6 mmol) NaHCO_3 至此溶液中，於室溫下攪拌混合物 12 小時。濾出固體，濾液於旋轉蒸發器上濃縮。粗產物溶於二氯甲烷，經 Na_2SO_4 脫水，過濾及濃縮。隨後取固體溶於少量二氯甲烷，添加異丙醇。產物自此溶劑混合物中結晶析出。產量：28.0 g (59%)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) : $\sigma = 3.40$ (d AB 之 H_A , $J = 19$ Hz, 1H, $\text{N}=\text{C}-\text{CH}_A\text{H}_B$), 3.48 (s, 3H, O- CH_3), 3.78 (d, AB 之 H_B , $J = 19$ Hz, 1H, $\text{N}=\text{C}-\text{CH}_A\text{H}_B$), 3.90 (s, 3H,

OCH₃), 7.43 (s, 1H, Ar-H), 7.55 (s, 2H, Ar-H)。

中間物 4：3-(3,5-二氯苯基)-5-甲氧基-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-羧酸(實例 A-115)

取 40.00 g (131.5 mmol) 3-(3,5-二氯苯基)-5-甲氧基-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-羧酸甲酯溶於 800 ml THF，然後慢慢添加 2.99 g LiOH 之 0.5 M 水溶液。於室溫下攪拌 2 小時，真空排除 THF 溶劑，添加 200 ml 半飽和 NaHCO₃ 溶液，使用乙酸乙酯萃取混合物。隨後，由水相與 300 ml 二氯甲烷混合，然後慢慢攪拌添加 0.5 N HCl，調整至 pH 1。取有機相經 Na₂SO₄ 脫水，過濾及濃縮。產量：35.4 g (88%)。

¹H NMR (CDCl₃) : σ = 3.45 (d AB 之 H_A, J = 19 Hz, 1H, N=C-CH_AH_B), 3.51 (s, 3H, OCH₃), 3.85 (d AB 之 H_B, J = 19 Hz, 1H, N=C-CH_AH_B), 7.45 (s, 1H, Ar-H), 7.56 (s, 2H, Ar-H), 9.3 (s br., 1H, COOH)。

實例 1.20-40

N-(氰基甲基)-3-(3,5-二氯苯基)-5-甲氧基-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-羧醯胺

先取 200 mg (0.689 mmol) 3-(3,5-二氯苯基)-5-甲氧基-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-羧酸加至 10 ml 二氯甲烷中，添加 93 mg (0.69 mmol) HOBT 及 57 mg (1.0 mmol) 2-胺基乙腈。隨後，添加 172 mg (0.896 mmol) 1-(3-二甲基胺基丙基)-3-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽，攪拌混合物 30 分鐘。操作時，使用水洗滌混合物，使用矽膠經庚烷/乙酸乙酯層析。產量：220 mg (92%)。

¹H NMR (CDCl₃) : σ = 3.36 (d AB 之 H_A, J = 19 Hz, 1H, N=C-CH_AH_B), 3.37 (s, 3H, OCH₃), 3.81 (d AB 之 H_B, J = 19 Hz, 1H, N=C-CH_AH_B), 4.27 (d AB, 2H; J_{AB} = 16 Hz, J_{AC} = 7 Hz, 2H, NH_C-CH_AH_B); 7.17 (t br, J=7 Hz, 1H, NH); 7.45 (s, 1H, Ar-H), 7.56 (s, 2H, Ar-H)。

中間物 5

2,2-二甲氧基丙酸甲酯

取 100 g (979 mmol) 2-側氧基丙酸甲酯與 135 g (1273 mmol) 原甲酸三甲酯於 240 ml 甲醇中混合。添加 0.96 g (9.79 mmol) 濃縮 H_2SO_4 後，加熱混合物至回流 4 小時。在 2 小時內蒸餾排除溶劑，粗產物冷卻至 10°C ，加至 10°C 之含 2.4 g KOH 之 1200 ml 水溶液中。使用乙醚重覆萃取後，產物經 Na_2SO_4 脫水，過濾及濃縮。殘質再蒸餾一次。沸點(10 mbar)： $50\text{-}55^\circ\text{C}$ 。產量：118 g (77%)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) : $\sigma = 1.53$ (s, 3H, C- CH_3), 3.29 (s, 6H, $\text{CH}_3\text{-O-C-O-CH}_3$), 3.82 (s, 3H, COOCH_3)。

中間物 6

2-甲氧基丙烯酸甲酯

先取 100 g (675 mmol) 2,2-二甲氧基丙酸甲酯加至 300 ml DMF 中，於攪拌下分批添加 52.7 g (371 mmol) P_2O_5 ，然後加熱混合物至 100°C 1 小時。添加反應溶液至冷卻至 10°C 之 1 升飽和 NaHCO_3 溶液中。此溶液使用乙醚萃取，取有機萃液使用飽和 NaCl 溶液洗滌 3 次，經 Na_2SO_4 脫水，過濾及濃縮。產物未經進一步純化即使用。產量：66.0 g (81%)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) : $\sigma = 3.67$ (s, 3H, C- CH_3), 3.83 (s, 3H, COOCH_3), 4.63 (d, 1H, $J=3\text{Hz}$, C= CHH), 5.37 (d, 1H, $J=3\text{Hz}$, C= CHH)。

中間物 7

2-乙氧基丙烯酸乙酯

類似中間物 6 之製法合成。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) : $\sigma = 1.33$ (t, 3H, $J=7\text{Hz}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$), 1.40 (t, 3H, $J=7\text{Hz}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$) 3.83 (q, 2H, $J=7\text{Hz}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$), 4.27 (q, 2H, $J=7\text{Hz}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{O}$), 4.58 (d, 1H, $J=3\text{Hz}$, C= CHH), 5.32 (d, 1H, $J=3\text{Hz}$, C= CHH)。

實例 3.11-9

3-(3,5-二氟苯基)-5-甲氧基-N-(2,2,2-三氟乙基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-羧硫醯胺

取 400 mg (1.182 mmol) 3-(3,5-二氟苯基)-5-甲氧基-N-(2,2,2-三氟乙基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-5-羧硫醯胺溶於 20 ml THF，分批添加共 478 mg (1.182 mmol) 勞森試劑。該澄清溶液隨後在微波爐中加熱至 80°C 2 小時。減壓排除溶劑，殘質溶於乙酸乙酯，使用飽和氯化鈉溶液萃取。取有機相經 Na₂SO₄ 脫水，過濾及濃縮。然後使用矽膠經乙酸乙酯/正庚烷層析純化。產量：150 mg (34%)。

¹H NMR (CDCl₃) : σ = 3.41 (s, 3H, O-CH₃); 3.57 (d AB 之 H_A, J = 19 Hz, 1H, N=C-CH_AH_B), 4.07 (d AB 之 H_B, J = 19 Hz, 1H, N=C-CH_AH_B), 4.26-4.41 (m, 1H, CHH-CF₃); 4.54-4.71 (m, 1H, CHH-CF₃); 6.92 (tt, 1H, 苯基-4H); 7.21 (d, 2H, Ar-2,6H); 8.70 (s br, 1H, NH)。

類似上述化合物之製法及依據該等製法之一般詳細說明，可製得下表中明確說明之化合物。此等表中所揭示實例之 NMR 數據係以(δ值，氫原子數，多重裂峰)型式表示。不同訊號峰之成對δ值/訊號強度數據係以分號分開。

表 1.1：本發明通式(I.1)化合物 1.1-1 至 1.1-266，其中 A-X 如下文中定義。

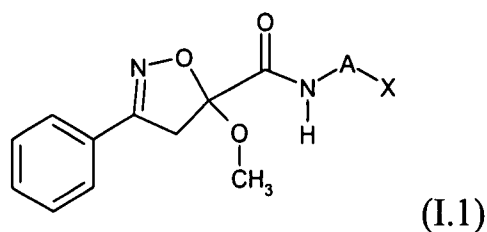
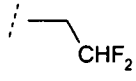
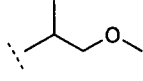
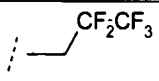
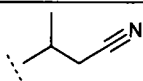
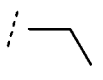
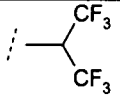
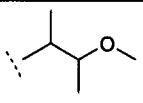
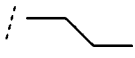
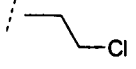
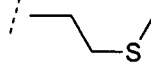
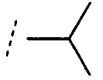
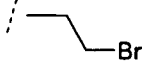
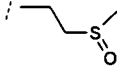
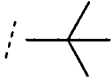
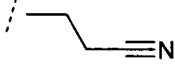
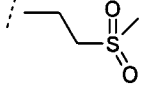
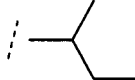
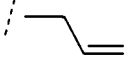
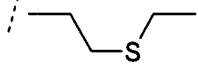
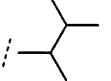
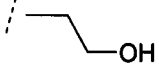
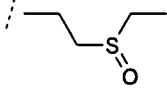
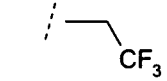
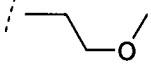
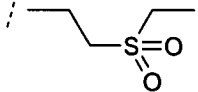
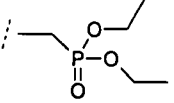
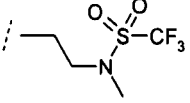
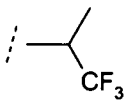
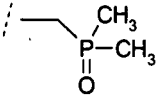
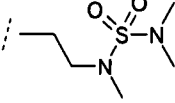
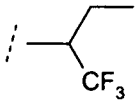
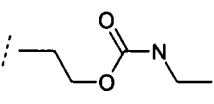
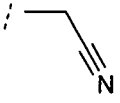
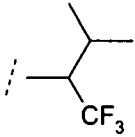
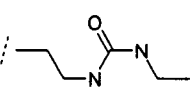
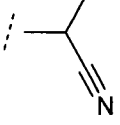
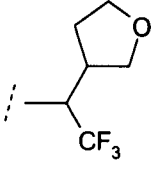
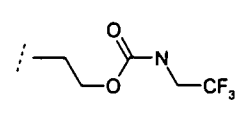
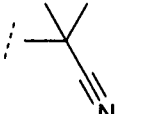
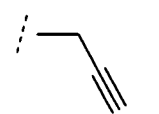
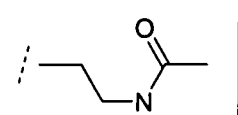
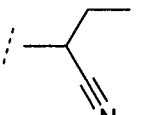
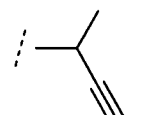
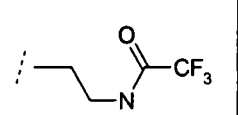
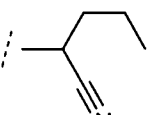
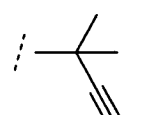
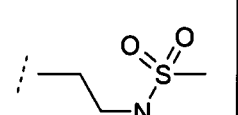
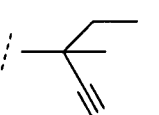
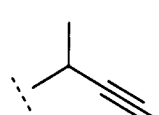
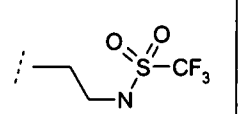
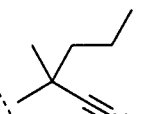

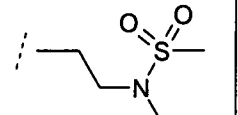

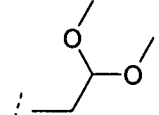
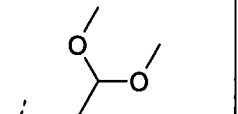
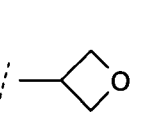
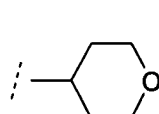
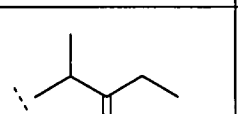
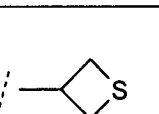
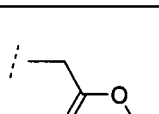
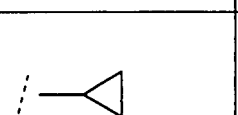
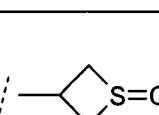
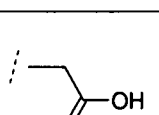

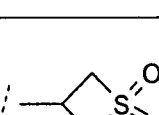
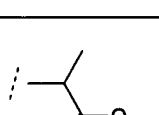
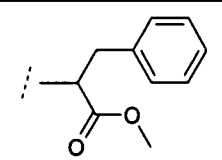
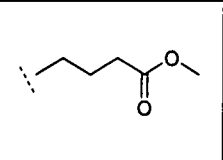
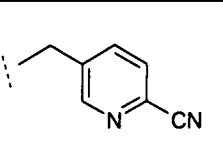
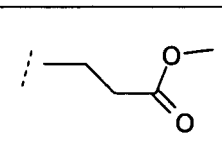
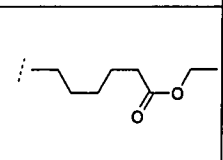
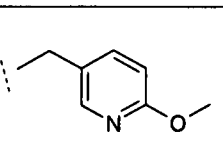
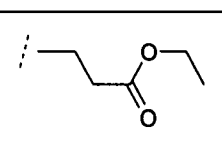
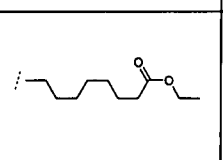
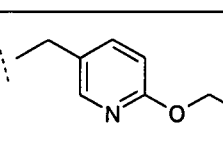
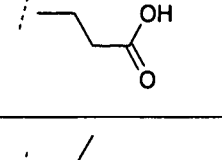
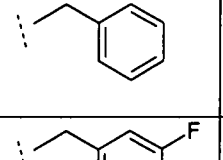
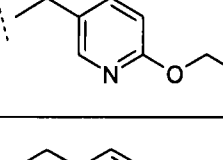
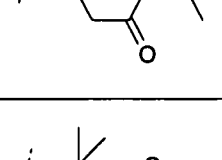
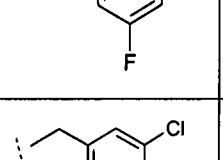
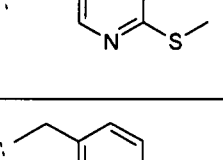
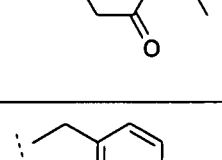
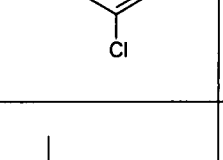
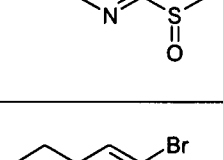
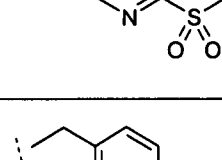
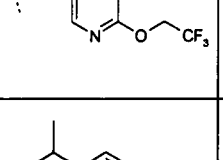
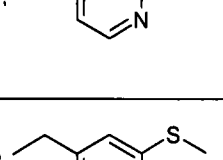
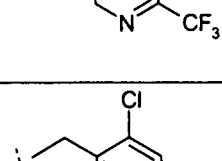
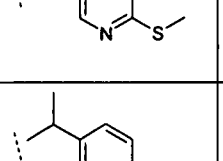
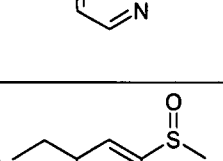
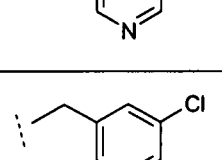
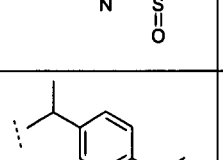
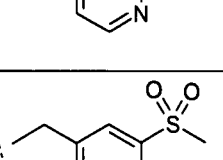
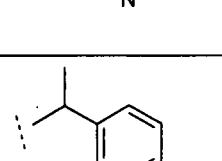
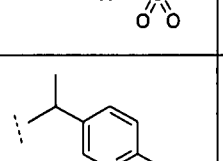
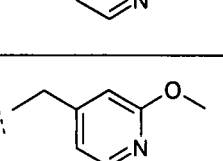
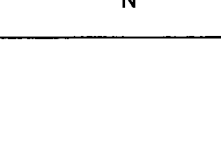
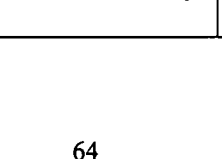
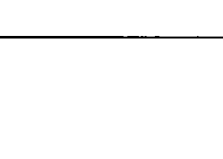


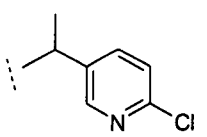
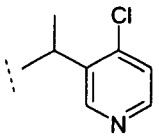
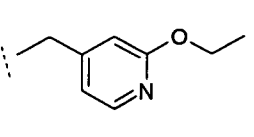
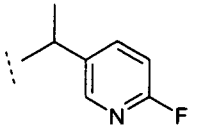
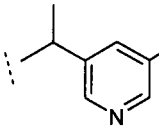
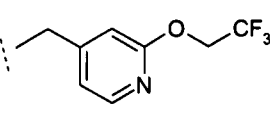
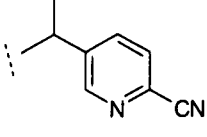
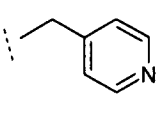
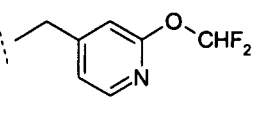
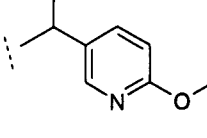
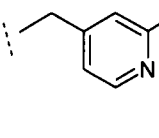
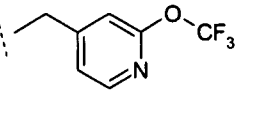
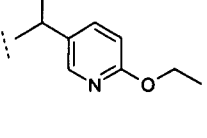
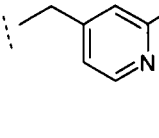
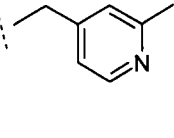
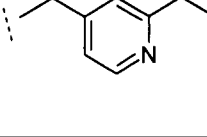
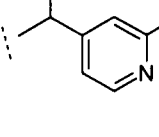
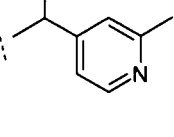
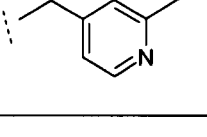
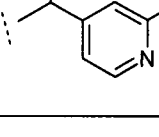
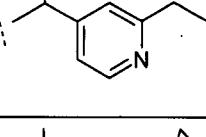
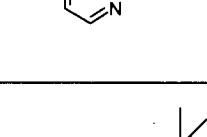
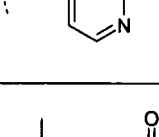
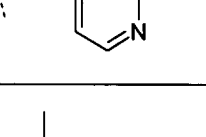
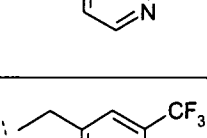
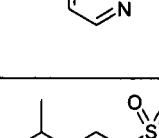
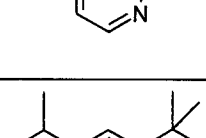
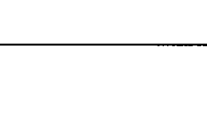
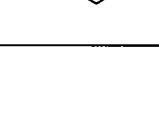

表 1.1：

| 編號 | —A—X | 編號 | —A—X | 編號 | —A—X |
|--------|---|--------|---|--------|---|
| 1.1-1 | —H | 1.1-10 |  | 1.1-19 |  |
| 1.1-2 | —CH ₃ | 1.1-11 |  | 1.1-20 |  |
| 1.1-3 |  | 1.1-12 |  | 1.1-21 |  |
| 1.1-4 |  | 1.1-13 |  | 1.1-22 |  |
| 1.1-5 |  | 1.1-14 |  | 1.1-23 |  |
| 1.1-6 |  | 1.1-15 |  | 1.1-24 |  |
| 1.1-7 |  | 1.1-16 |  | 1.1-25 |  |
| 1.1-8 |  | 1.1-17 |  | 1.1-26 |  |
| 1.1-9 |  | 1.1-18 |  | 1.1-27 |  |
| 1.1-28 |  | 1.1-38 |  | 1.1-48 |  |
| 1.1-29 |  | 1.1-39 |  | 1.1-49 |  |
| 1.1-30 |  | 1.1-40 |  | 1.1-50 |  |
| 1.1-31 |  | 1.1-41 |  | 1.1-51 |  |

| 編號 | —A—X | 編號 | —A—X | 編號 | —A—X |
|--------|---|--------|---|--------|---|
| 1.1-32 |  | 1.1-42 |  | 1.1-52 |  |
| 1.1-33 |  | 1.1-43 |  | 1.1-53 |  |
| 1.1-34 |  | 1.1-44 |  | 1.1-54 |  |
| 1.1-35 |  | 1.1-45 |  | 1.1-55 |  |
| 1.1-36 |  | 1.1-46 |  | 1.1-56 |  |
| 1.1-37 |  | 1.1-47 |  | 1.1-57 |  |
| 1.1-58 |  | 1.1-68 |  | 1.1-78 |  |
| 1.1-59 |  | 1.1-69 |  | 1.1-79 |  |
| 1.1-60 |  | 1.1-70 |  | 1.1-80 |  |
| 1.1-61 |  | 1.1-71 |  | 1.1-81 |  |

| 編號 | —A—X | 編號 | —A—X | 編號 | —A—X |
|--------|------|---------|------|---------|------|
| 1.1-62 | | 1.1-72 | | 1.1-82 | |
| 1.1-63 | | 1.1-73 | | 1.1-83 | |
| 1.1-64 | | 1.1-74 | | 1.1-84 | |
| 1.1-65 | | 1.1-75 | | 1.1-85 | |
| 1.1-66 | | 1.1-76 | | 1.1-86 | |
| 1.1-67 | | 1.1-77 | | 1.1-87 | |
| 1.1-88 | | 1.1-98 | | 1.1-108 | |
| 1.1-89 | | 1.1-99 | | 1.1-109 | |
| 1.1-90 | | 1.1-100 | | 1.1-110 | |
| 1.1-91 | | 1.1-101 | | 1.1-111 | |

| 編號 | —A—X | 編號 | —A—X | 編號 | —A—X |
|---------|---|-------------|---|---------|---|
| 1.1-92 |  | 1.1-102 |  | 1.1-112 |  |
| 1.1-93 |  | 1.1-103 |  | 1.1-113 |  |
| 1.1-94 |  | 1 1.1-04 |  | 1.1-114 |  |
| 1.1-95 |  | 1.1-105 |  | 1.1-115 |  |
| 1.1-96 |  | 1.1-106 |  | 1.1-116 |  |
| 1.1-97 |  | 1.1-107 |  | 1.1-117 |  |
| 1.1-118 |  | 1.1-128 |  | 1.1-138 |  |
| 1.1-119 |  | 1.1-129 |  | 1.1-139 |  |
| 1.1-120 |  | 1.1-130 |  | 1.1-140 |  |
| 1.1-121 |  | 1.1-131 |  | 1.1-141 |  |
| 1.1-122 |  | 1.1-132 |  | 1.1-142 |  |

| 編號 | ---A---X | 編號 | ---A---X | 編號 | ---A---X |
|---------|---|---------|---|---------|---|
| 1.1-123 |  | 1.1-133 |  | 1.1-143 |  |
| 1.1-124 |  | 1.1-134 |  | 1.1-144 |  |
| 1.1-125 |  | 1.1-135 |  | 1.1-145 |  |
| 1.1-126 |  | 1.1-136 |  | 1.1-146 |  |
| 1.1-127 |  | 1.1-137 |  | 1.1-147 |  |
| 1.1-148 |  | 1.1-158 |  | 1.1-168 |  |
| 1.1-149 |  | 1.1-159 |  | 1.1-169 |  |
| 1.1-150 |  | 1.1-160 |  | 1.1-170 |  |
| 1.1-151 |  | 1.1-161 |  | 1.1-171 |  |
| 1.1-152 |  | 1.1-162 |  | 1.1-172 |  |

| 編號 | —A—X | 編號 | —A—X | 編號 | —A—X |
|---------|------|---------|------|---------|------|
| 1.1-153 | | 1.1-163 | | 1.1-173 | |
| 1.1-154 | | 1.1-164 | | 1.1-174 | |
| 1.1-155 | | 1.1-165 | | 1.1-175 | |
| 1.1-156 | | 1.1-166 | | 1.1-176 | |
| 1.1-157 | | 1.1-167 | | 1.1-177 | |
| 1.1-178 | | 1.1-188 | | 1.1-198 | |
| 1.1-179 | | 1.1-189 | | 1.1-199 | |
| 1.1-180 | | 1.1-190 | | 1.1-200 | |
| 1.1-181 | | 1.1-191 | | 1.1-201 | |
| 1.1-182 | | 1.1-192 | | 1.1-202 | |

| 編號 | —A—X | 編號 | —A—X | 編號 | —A—X |
|---------|------|---------|------|---------|------|
| 1.1-183 | | 1.1-193 | | 1.1-203 | |
| 1.1-184 | | 1.1-194 | | 1.1-204 | |
| 1.1-185 | | 1.1-195 | | 1.1-205 | |
| 1.1-186 | | 1.1-196 | | 1.1-206 | |
| 1.1-187 | | 1.1-197 | | 1.1-207 | |
| 1.1-208 | | 1.1-218 | | 1.1-228 | |
| 1.1-209 | | 1.1-219 | | 1.1-229 | |
| 1.1-210 | | 1.1-220 | | 1.1-230 | |
| 1.1-211 | | 1.1-221 | | 1.1-231 | |
| 1.1-212 | | 1.1-222 | | 1.1-232 | |
| 1.1-213 | | 1.1-223 | | 1.1-233 | |

| 編號 | —A—X | 編號 | —A—X | 編號 | —A—X |
|---------|------|---------|------|---------|------|
| 1.1-214 | | 1.1-224 | | 1.1-234 | |
| 1.1-215 | | 1.1-225 | | 1.1-235 | |
| 1.1-216 | | 1.1-226 | | 1.1-236 | |
| 1.1-217 | | 1.1-227 | | 1.1-237 | |
| 1.1-238 | | 1.1-248 | | 1.1-258 | |
| 1.1-239 | | 1.1-249 | | 1.1-259 | |
| 1.1-240 | | 1.1-250 | | 1.1-260 | |
| 1.1-241 | | 1.1-251 | | 1.1-261 | |
| 1.1-242 | | 1.1-252 | | 1.1-262 | |
| 1.1-243 | | 1.1-253 | | 1.1-263 | |

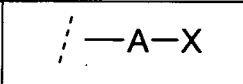
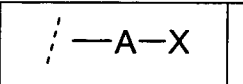
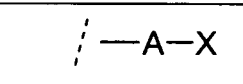
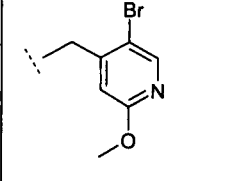
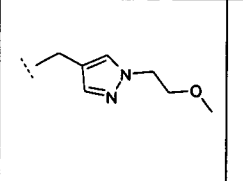
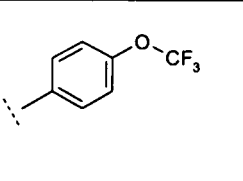
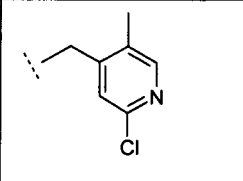
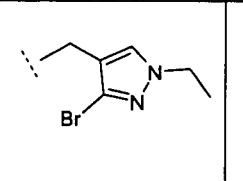
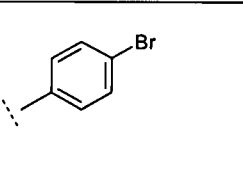
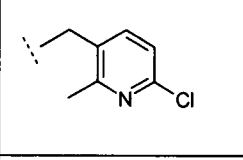
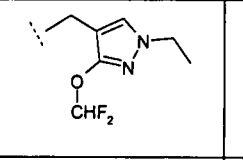
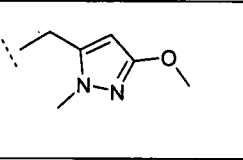
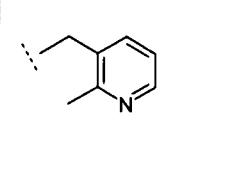
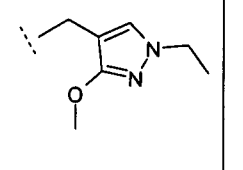
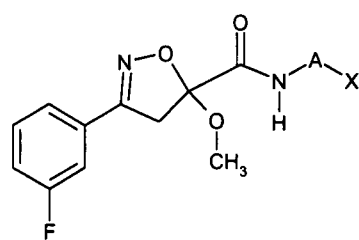
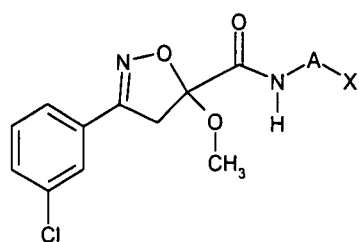
| 編號 |  | 編號 |  | 編號 |  |
|---------|---|---------|---|---------|---|
| 1.1-244 |  | 1.1-254 |  | 1.1-264 |  |
| 1.1-245 |  | 1.1-255 |  | 1.1-265 |  |
| 1.1-246 |  | 1.1-256 |  | 1.1-266 |  |
| 1.1-247 |  | 1.1-257 |  | | |

表 1.2：本發明通式(I.2)化合物 1.2-1 至 1.2-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。



(I.2)

表 1.3：本發明通式(I.3)化合物 1.3-1 至 1.3-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。



(I.3)

表 1.4：本發明通式(I.4)化合物 1.4-1 至 1.4-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

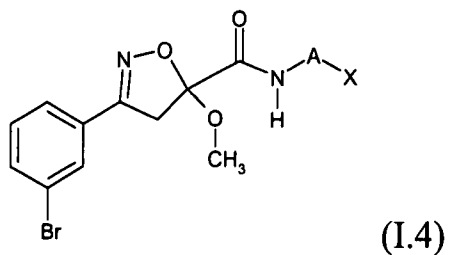


表 1.5：本發明通式(I.5)化合物 1.5-1 至 1.5-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

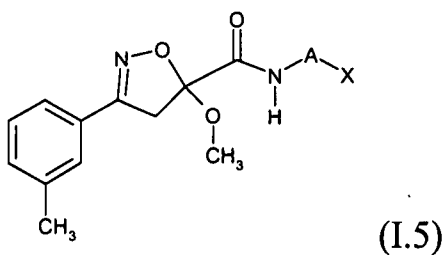


表 1.6：本發明通式(I.6)化合物 1.6-1 至 1.6-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

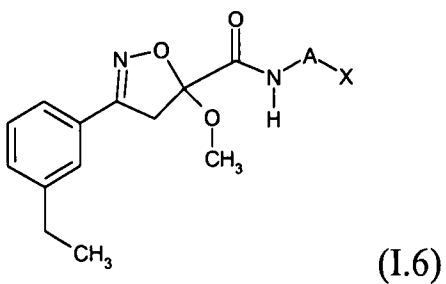


表 1.7：本發明通式(I.7)化合物 1.7-1 至 1.7-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

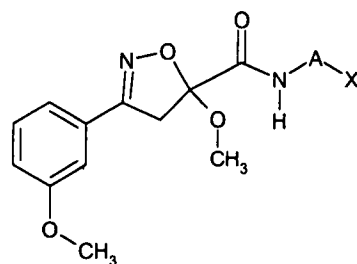


表 1.8：本發明通式(I.8)化合物 1.8-1 至 1.8-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

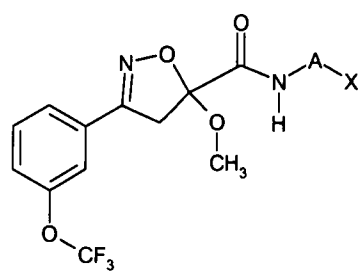


表 1.9：本發明通式(I.9)化合物 1.9-1 至 1.9-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

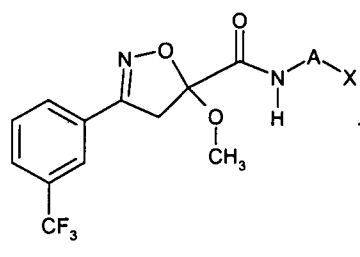


表 1.10：本發明通式(I.10)化合物 1.10-1 至 1.10-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

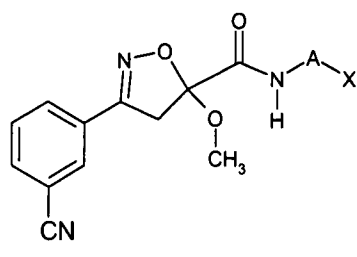
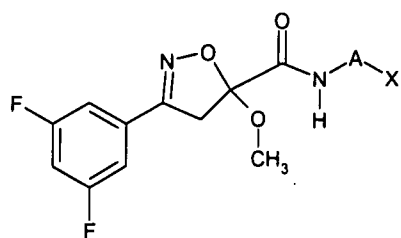


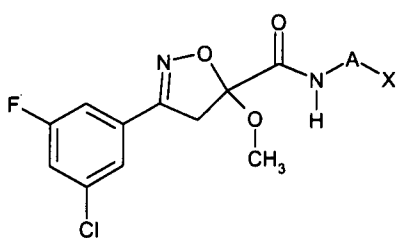
表 1.11：本發明通式(I.11)化合物 1.11-1 至 1.11-266，其中 A-X 如表 1.1 中

之定義。



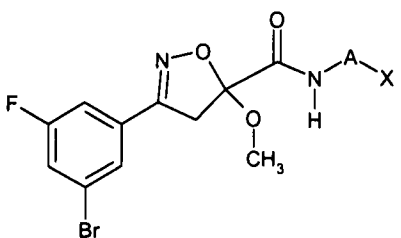
(I.11)

表 1.12：本發明通式(I.12)化合物 1.12-1 至 1.12-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。



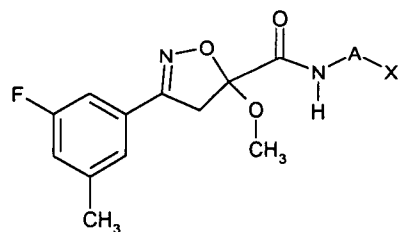
(I.12)

表 1.13：本發明通式(I.13)化合物 1.13-1 至 1.13-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。



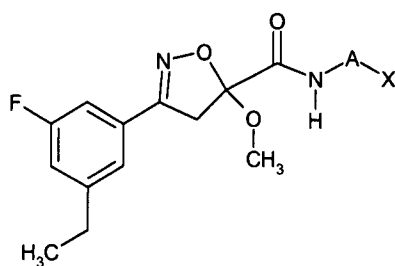
(I.13)

表 1.14：本發明通式(I.14)化合物 1.14-1 至 1.14-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。



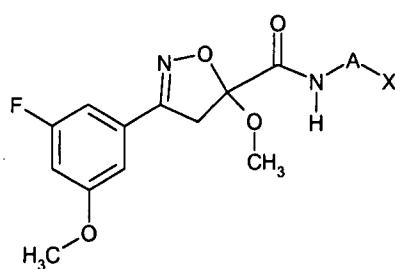
(I.14)

表 1.15：本發明通式(I.15)化合物 1.15-1 至 1.15-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。



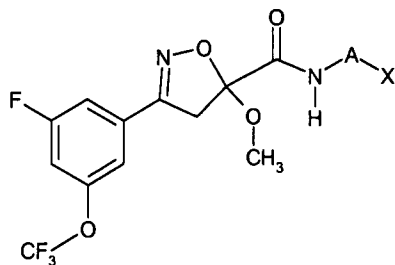
(I.15)

表 1.16：本發明通式(I.16)化合物 1.16-1 至 1.16-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。



(I.16)

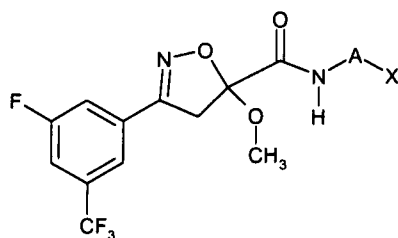
表 1.17：本發明通式(I.17)化合物 1.17-1 至 1.17-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。



(I.17)

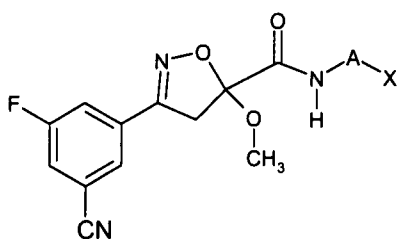
表 1.18：本發明通式(I.18)化合物 1.18-1 至 1.18-266，其中 A-X 如表 1.1 中

之定義。



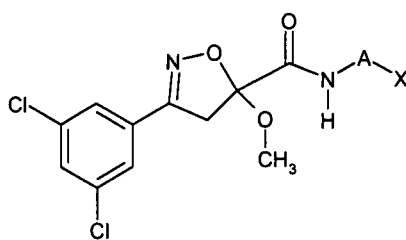
(I.18)

表 1.19：本發明通式(I.19)化合物 1.19-1 至 1.19-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。



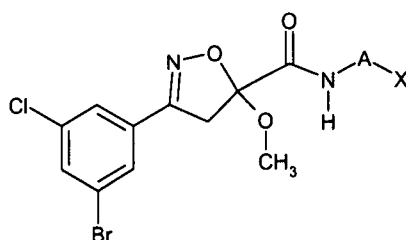
(I.19)

表 1.20：本發明通式(I.20)化合物 1.20-1 至 1.20-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。



(I.20)

表 1.21：本發明通式(I.21)化合物 1.21-1 至 1.21-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。



(I.21)

表 1.22：本發明通式(I.22)化合物 1.22-1 至 1.22-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

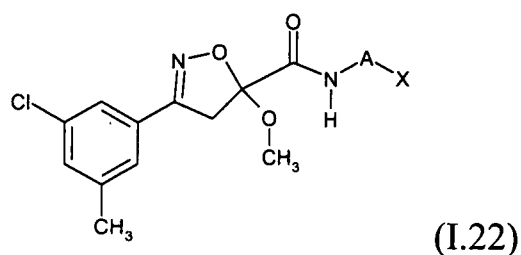


表 1.23：本發明通式(I.23)化合物 1.23-1 至 1.23-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

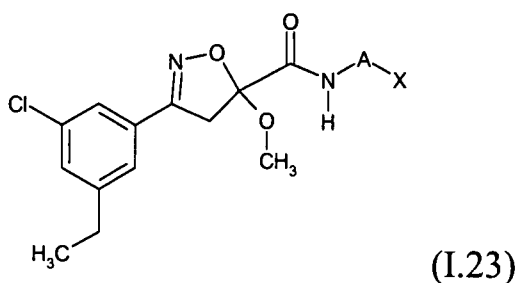


表 1.24：本發明通式(I.24)化合物 1.24-1 至 1.24-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

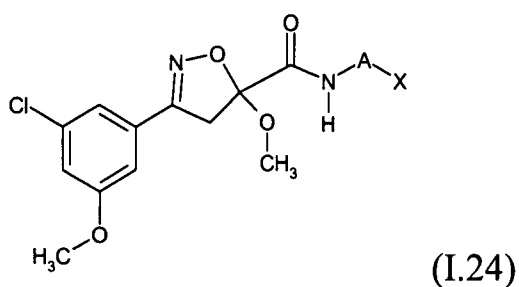


表 1.25：本發明通式(I.25)化合物 1.25-1 至 1.25-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

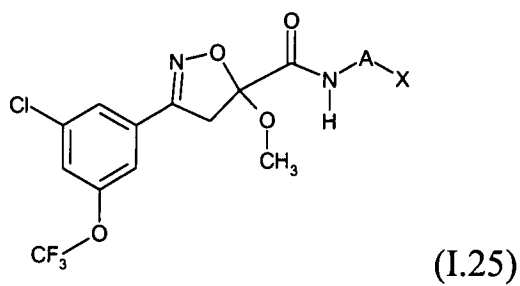


表 1.26：本發明通式(I.26)化合物 1.26-1 至 1.26-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

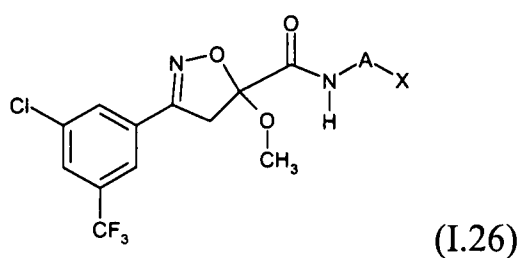


表 1.27：本發明通式(I.27)化合物 1.27-1 至 1.27-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

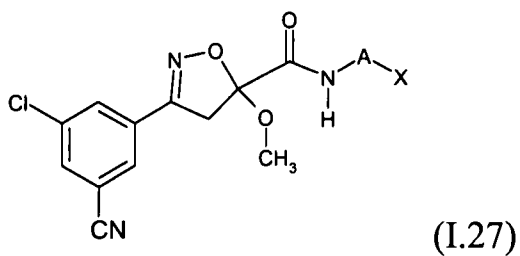


表 1.28：本發明通式(I.28)化合物 1.28-1 至 1.28-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

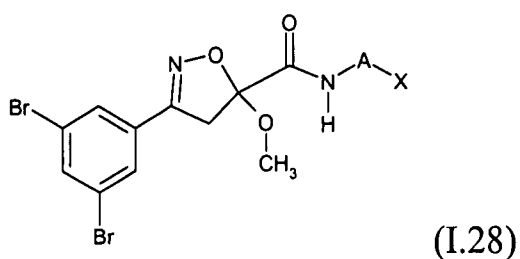


表 1.29：本發明通式(I.29)化合物 1.29-1 至 1.29-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

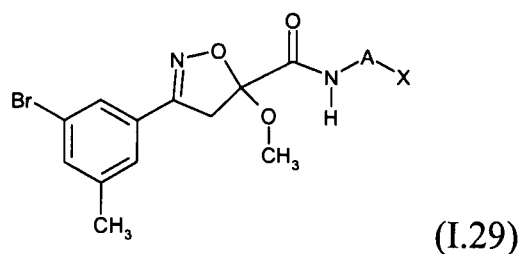


表 1.30：本發明通式(I.30)化合物 1.30-1 至 1.30-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

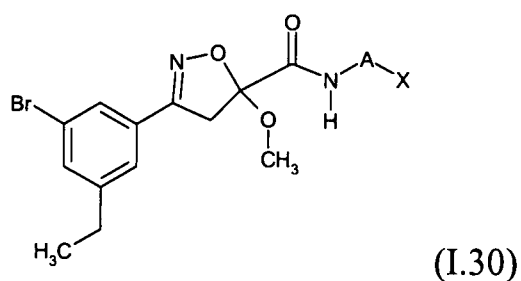


表 1.31：本發明通式(I.31)化合物 1.31-1 至 1.31-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

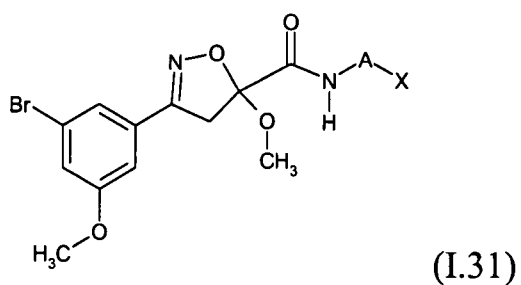


表 1.32：本發明通式(I.32)化合物 1.32-1 至 1.32-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

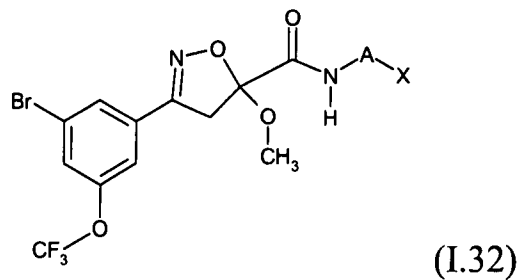


表 1.33：本發明通式(I.33)化合物 1.33-1 至 1.33-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

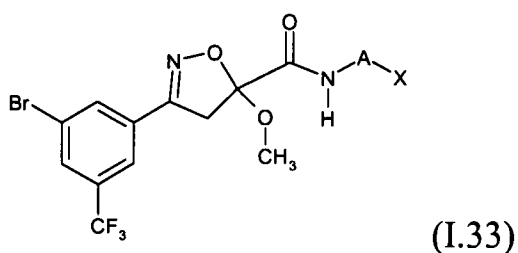


表 1.34：本發明通式(I.34)化合物 1.34-1 至 1.34-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

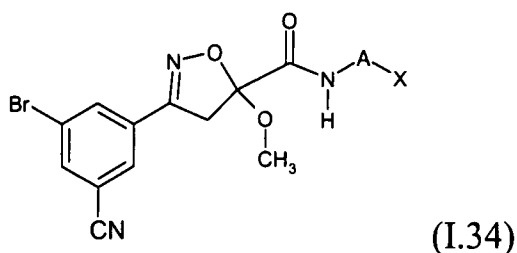


表 1.35：本發明通式(I.35)化合物 1.35-1 至 1.35-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

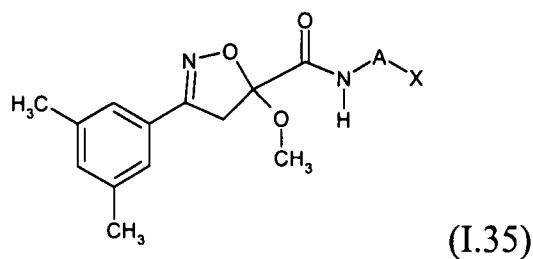


表 1.36：本發明通式(I.36)化合物 1.36-1 至 1.36-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

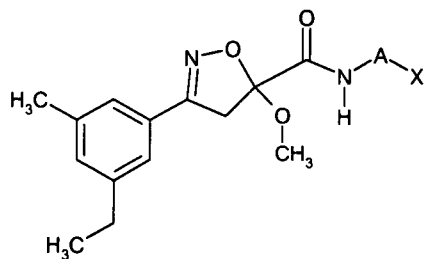


表 1.37：本發明通式(I.37)化合物 1.37-1 至 1.37-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

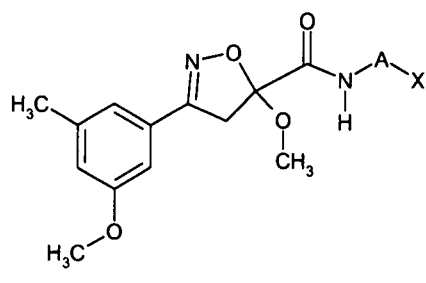


表 1.38：本發明通式(I.38)化合物 1.38-1 至 1.38-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

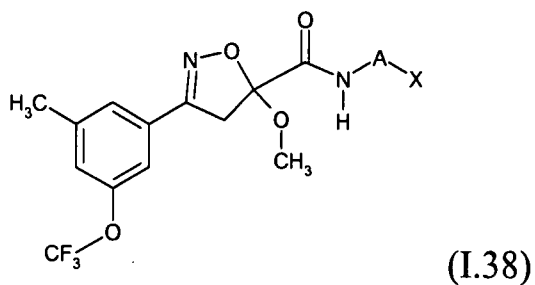


表 1.39：本發明通式(I.39)化合物 1.39-1 至 1.39-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

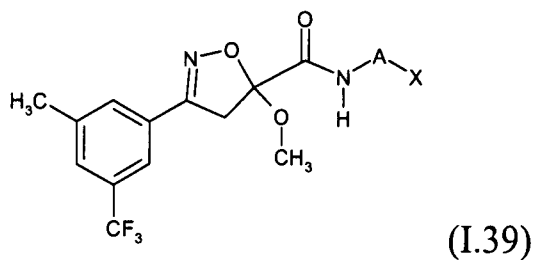


表 1.40：本發明通式(I.40)化合物 1.40-1 至 1.40-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

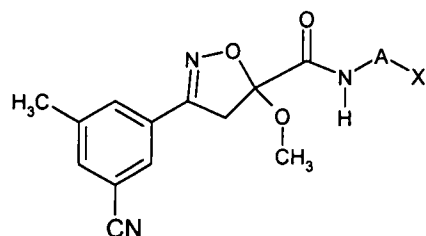


表 1.41：本發明通式(I.41)化合物 1.41-1 至 1.41-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

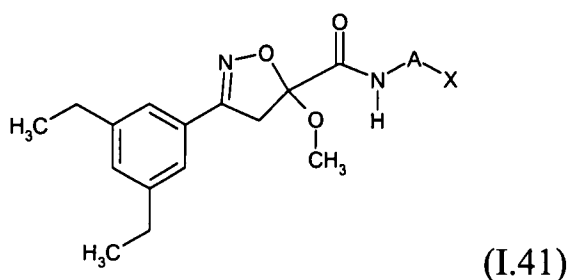


表 1.42：本發明通式(I.42)化合物 1.42-1 至 1.42-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

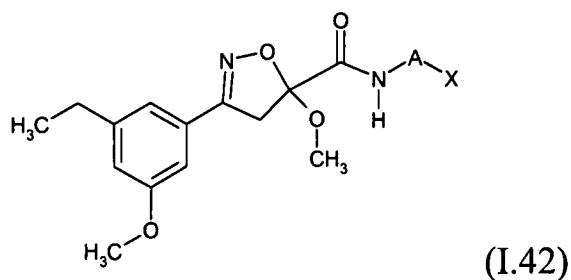


表 1.43：本發明通式(I.43)化合物 1.43-1 至 1.43-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

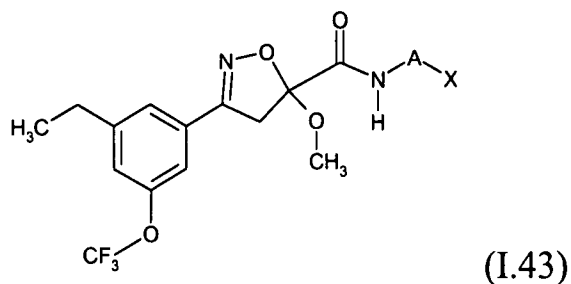


表 1.44：本發明通式(I.44)化合物 I.44-1 至 I.44-266，其中 A-X 如表 1.1 中之

定義。

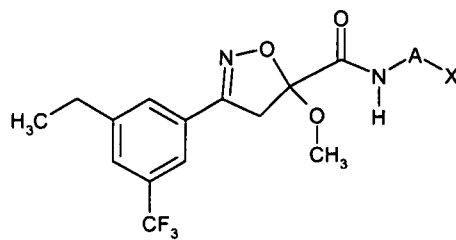


表 1.45：本發明通式(I.45)化合物 I.45-1 至 I.45-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

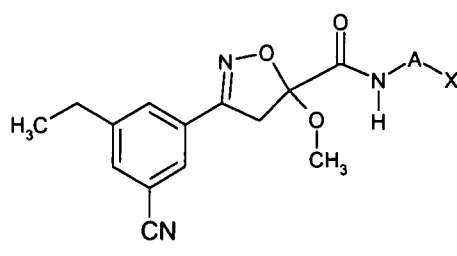


表 1.46：本發明通式(I.46)化合物 I.46-1 至 I.46-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

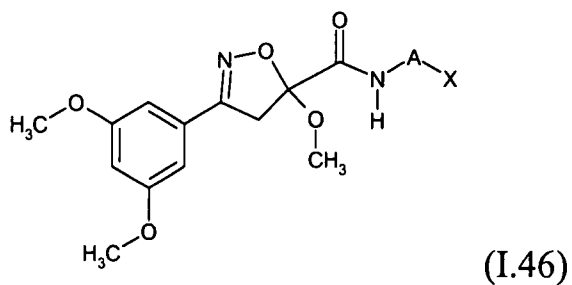


表 1.47：本發明通式(I.47)化合物 1.47-1 至 1.47-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

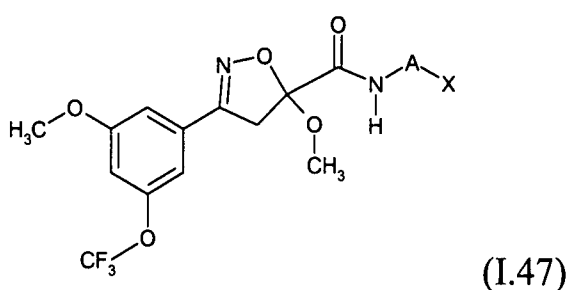


表 1.48：本發明通式(I.48)化合物 1.48-1 至 1.48-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

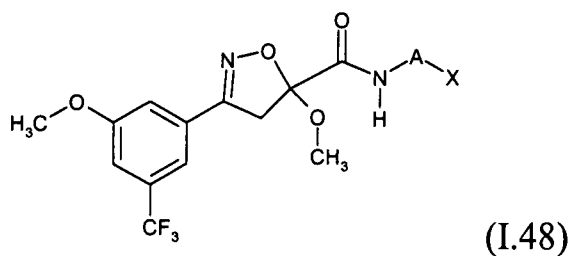


表 1.49：本發明通式(I.49)化合物 1.49-1 至 1.49-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

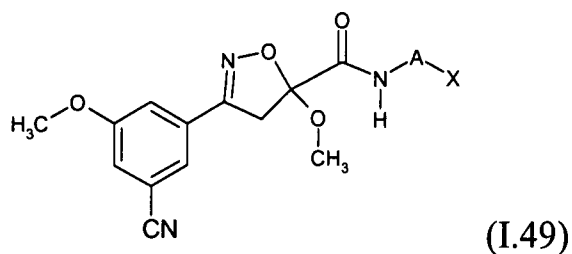


表 1.50：本發明通式(I.50)化合物 1.50-1 至 1.50-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

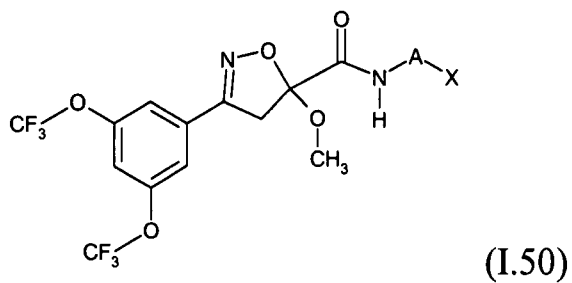


表 1.51：本發明通式(I.51)化合物 1.51-1 至 1.51-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

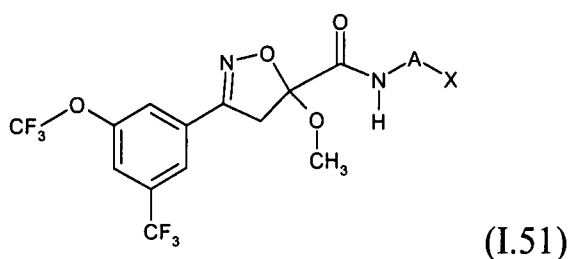


表 1.52：本發明通式(I.52)化合物 1.52-1 至 1.52-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

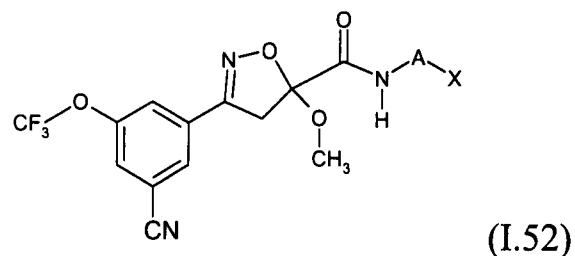


表 1.53：本發明通式(I.53)化合物 1.53-1 至 1.53-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

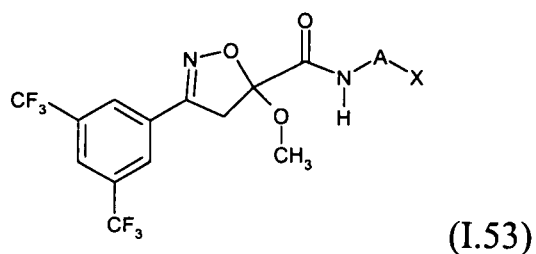


表 1.54：本發明通式(I.54)化合物 1.54-1 至 1.54-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

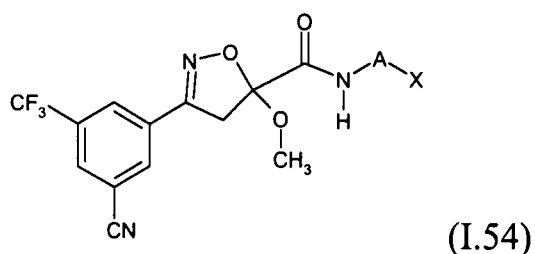


表 1.55：本發明通式(I.55)化合物 1.55-1 至 I.55-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

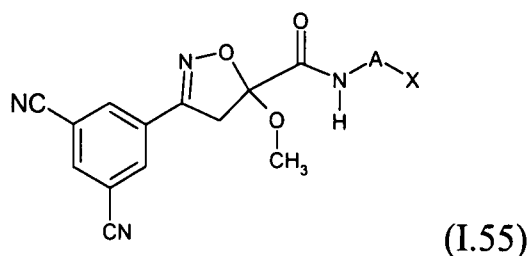


表 1.56：本發明通式(I.56)化合物 1.56-1 至 I.56-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。

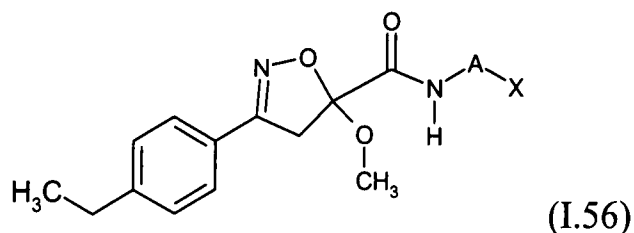
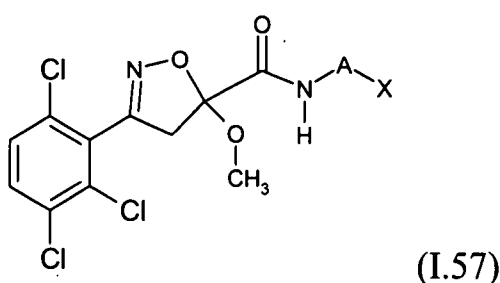


表 1.57：本發明通式(I.57)化合物 1.57-1 至 I.57-266，其中 A-X 如表 1.1 中之定義。



類似表 1.1 至 1.57 明確說明之彼等本發明化合物之方法，相應地產生表 2.1 至 2.57 之本發明化合物，其中 Y 為氧，R³ 為乙基，及其他取代基分別如表 1.1 至 1.57 之定義。

類似表 1.1 至 1.57 明確說明之彼等本發明化合物之方法，相應地產生表 3.1 至 3.57 之本發明化合物，其中 Y 為硫，R³ 為甲基，及其他取代基分別如表 1.1 至 1.57 之定義。

類似表 1.1 至 1.57 明確說明之彼等本發明化合物之方法，相應地產生表 4.1 至 4.57 之本發明化合物，其中 Y 為硫，R³ 為乙基，及其他取代基分別如表 1.1 至 1.57 之定義。

所採用之縮寫定義如下：

| | | | | | | | |
|----|------|-----|----|-----|----|----|----|
| Ac | 乙醯氧基 | Bu | 丁基 | Et | 乙基 | Me | 甲基 |
| Pr | 丙基 | Pen | 戊基 | Hex | 己基 | Ph | 苯基 |
| c | 環 | s | 二級 | i | 異 | t | 三級 |

E1、E2、E3、E4 代表純對映異構性化合物。D1、D2、D3、D4 代表呈兩種對映異構物之消旋物之成對非對映異構物之非對映異構物。

分析數據表 1.2

| 編號 | NMR |
|-----------|---|
| 1.2-7 | [CDCl ₃] 0.89-0.97 (m,3H) ; 1.17-1.21 (m,3H) ; 1.52 (m,2H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.42 (m,1H) ; 3.84 (m,1H) ; 3.96 (m,1H) ; 6.58 (d,1H) ; 7.16 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-8 | [CDCl ₃] 0.93 (m,6H) ; 1.14 (m,3H) ; 1.76 (m,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.42 (m,1H) ; 3.78-3.86 (m,1H), 3.91 (m,1H) ; 6.61 (d,1H) ; 7.16 (m,1H) ; 7.41 (m,3H). |
| 1.2-10 | [CDCl ₃] 3.38 (s,3H) ; 3.44 (d,1H) ; 3.62-3.79 (m,2H) ; 3.90 (d,1H) ; 5.77-6.05 (tt,1H) ; 7.06 (s,1H) ; 7.15 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-11 | [CDCl ₃] 3.39 (s,3H) ; 3.44 (d,1H) ; 3.85 (d,1H), 3.90-4.00 (m,1H) ; 4.10-4.20 (m,1H) ; 7.05 (s,1H) ; 7.17 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-15 | [CDCl ₃] 2.67-2.73 (m,2H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.59-3.68 (m,2H) ; 3.91 (d,1H) ; 7.18 (m,2H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-16 | [CDCl ₃] 3.39 (s,3H) ; 3.44 (d,1H) ; 3.89 (d,1H) ; 3.92-4.03 (m,2H) ; 5.18-5.27 (m,2H) ; 5.82-5.91 (m,1H) ; 6.88 (s,1H) ; 7.15 (m,1H) ; 7.41 (m,3H). |
| 1.2-20 | [CDCl ₃] 1.43 (m,3H) ; 2.57-2.67 (m,1H) ; 2.75-2.90 (m,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.40 (m,1H) ; 3.88 (m,1H) ; 4.29 (m,1H) ; 6.86 (t,1H) ; 7.16 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-21 | [CDCl ₃] 1.13 (m,6H) ; 1.22 (m,1H) ; 3.34-3.44 (m,7H) ; 3.77-3.87 (m,1H) ; 4.05 (m,1H) ; 7.02 (t,1H) ; 7.13 (m,1H) ; 7.41 (m,3H). |
| 1.2-24 | [CDCl ₃] 3.00 (s,3H) ; 3.26-3.38 (m,6H) ; 3.81-3.95 (m,3H) ; 7.16 (m,1H) ; 7.41 (m,4H). |
| 1.2-25 | [CDCl ₃] 1.28 (t,3H) ; 2.58 (q,2H) ; 2.72 (t,2H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.55 (m,2H) ; 3.88 (d,1H) ; 7.13 (m,2H) ; 7.41 (m,3H). |
| 1.2-40 | [CDCl ₃] 3.38 (s,3H) ; 3.44 (d,1H) ; 3.94 (d,1H) ; 4.18-4.24 (m,1H) ; 4.32-4.38 (m, 1H) ; 7.19 (m,2H) ; 7.41 (m,3H). |
| 1.2-41 D1 | [CDCl ₃] D1 : 1.65 (d,3H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.45 (d,1H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.95 (m,1H) ; 7.09 (d,1H) ; 7.17 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-41 D2 | [CDCl ₃] D2 : 1.63 (d,3H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.97 (d,1H) ; 4.93 (m,1H) ; 7.08 (d,1H) ; 7.17 (m,1H) ; 7.43 (m,3H). |
| 1.2-42 | [CDCl ₃] 1.78 (s,6H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.99 (d,1H) ; 6.73 (s,1H) ; 7.17 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-45 | [CDCl ₃] 1.09-1.17 (m,3H) ; 1.73 (s,3H) ; 1.96-2.12 (m,2H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.40 (m,1H) ; 3.94-4.00 (m,1H) ; 6.80 (d,1H) ; 7.16 (m,1H) ; 7.43 (m,3H). |

| 編號 | NMR |
|-----------|---|
| 1.2-46 | [CDCl ₃] 1.03 (m,3H) ; 1.53-1.59 (m,2H) ; 1.75 (s,3H) ; 1.88-2.07 (m,2H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.40 (m,1H) ; 3.98 (m,1H) ; 6.81 (d,1H) ; 7.16 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-47 | [CDCl ₃] 0.71-0.78 (m,4H) ; 1.31 (m,1H) ; 1.83 (d,3H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.41 (m,1H) ; 3.90-4.01 (m,1H), 7.01 (d,1H) ; 7.17 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-48 D1 | [CDCl ₃] D1 : 1.40 (d,3H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.45 (d,1H) ; 3.83 (d,1H) ; 4.73 (m,1H) ; 6.83 (d,1H) ; 7.18 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-48 D2 | [CDCl ₃] D2 : 1.39 (d,3H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.87 (d,1H) ; 4.73 (m,1H) ; 6.89 (d,1H) ; 7.18 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-49 D1 | [CDCl ₃] D1 : 1.04 (t,3H) ; 1.58-1.65 (m,1H) ; 1.90-1.98 (m,1H) ; 3.40 (s,3H) ; 3.49 (d,1H) ; 3.80 (d,1H) ; 4.55 (m,1H) ; 6.73 (d,1H) ; 7.17 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-49 D2 | [CDCl ₃] D2 : 1.02 (t,3H) ; 1.56-1.65 (m,1H) ; 1.90-1.98 (m,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.45 (d,1H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.55 (m,1H) ; 6.78 (d,1H) ; 7.18 (m,1H) ; 7.43 (m,3H). |
| 1.2-50 | [CDCl ₃] 1.00-1.07 (m,6H) ; 2.22 (m,1H) ; 3.39 (d,3H) ; 3.45 (m,1H) ; 3.75-3.92 (dd,1H) ; 4.53 (m,1H) ; 6.88 (m,1H) ; 7.17 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-51 | [CDCl ₃] 1.61-1.66 (m,1H) ; 1.91 (m,2H) ; 2.09 (m,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.85-3.99 (m,3H) ; 4.30 (t,1H), 4.65 (quint,1H) ; 7.17 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-53 | [CDCl ₃] 1.49 (t,3H) ; 2.30 (dd,1H) ; 3.38 (d,3H) ; 3.43 (m,1H) ; 3.85 (m,1H) ; 4.84 (m,1H) ; 6.96 (s,1H) ; 7.15 (m,1H) ; 7.41 (m,3H). |
| 1.2-55 | [CDCl ₃] 1.43 (m,3H) ; 1.81 (m,3H) ; 3.38 (d,3H) ; 3.41 (m,1H) ; 3.83 (m,1H) ; 4.78 (m,1H) ; 6.91 (s,1H) ; 7.17 (m,1H) ; 7.40 (m,3H). |
| 1.2-58 | [CDCl ₃] 1.19 (m,3H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.41-3.47 (m,7H) ; 3.88 (m,1H), 4.21 (m,2H), 6.89 (s,1H), 7.15 (m,1H) ; 7.41 (m,3H). |
| 1.2-59 | [CDCl ₃] 1.12 (q,3H) ; 1.42 (m,3H) ; 2.49-2.68 (m,2H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.42 (m,1H) ; 3.84 (m,1H) ; 4.63 (m,1H) ; 7.15 (m,1H) ; 7.39-7.47 (m,4H). |
| 1.2-60 | [CDCl ₃] 0.57-0.61 (m,2H) ; 0.82-0.87 (m,2H) ; 2.82 (m,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.88 (d,1H) ; 6.82 (s,1H) ; 7.14 (m,1H) ; 7.41 (m,3H). |
| 1.2-62 | [CDCl ₃] 0.22-0.30 (m,1H) ; 0.32-0.40 (m,1H) ; 0.44-0.56 (m,2H) ; 0.87 (m,1H) ; 1.27 (m,3H) ; 3.38-3.48 (m,5H) ; 3.78-3.84 (m,1H) ; 6.79 (s,1H) ; 7.15 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-64 | [CDCl ₃] 1.33 (m,2H) ; 1.62 (m,2H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.99 (d,1H) ; 7.17 (m,1H) ; 7.23 (s,1H) ; 7.41 (m,3H). |
| 1.2-69 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.40(m,4H) ; 3.87(d,1H) ; 5.22-5.33 (m,1H) ; 7.12-7.20 (m,1H) ; 7.22(s br,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-70 | [CDCl ₃] 3.24-3.34(m,2H) ; 3.40 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.49-3.59 (m,1H) ; 3.67-3.74(m,1H); 3.91 (dd,1H); 4.09-4.19 (m,2H); 4.42-4.54 (m,1H); 5.15-5.25 (m,1H) ; 7.13-7.20(m,1H) ; 7.32 (s br,1H) ; 7.40 (m,1H). |
| 1.2-71 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.94 (d,1H) ; 4.02-4.13 (m, 2H) ; 4.53-4.13(m,2H) ; 4.70-4.80 (m,1H) ; 7.13-7.20 (m,1H) ; 7.38 (d br,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-73 | [CDCl ₃] 1.83 -1.92 (m,1H) ; 2.26-2.38 (m,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.38 (dd,1H) ; 3.70-3.76 (m,1H); 3.78-3.91(m,3H); 3.94-4.02(m,1H); 4.51-4.61 (m,1H); 6.95 |

| 編號 | NMR |
|---------|--|
| | (s br,1H) ; 7.18 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-76 | [CDCl ₃] 0.89-0.96 (m,3H) ; 1.19 (m,3H) ; 1.32-1.40 (m,2H) ; 1.42-1.50 (m,2H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.41 (m,1H), 3.79-3.86 (m,1H) ; 4.04 (m,1H) ; 6.54 (d,1H) ; 7.15 (m,1H) ; 7.41 (m,3H). |
| 1.2-94 | [CDCl ₃] 1.28 (t,3H) ; 2.59 (t,2H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.62 (m,2H) ; 3.83 (d,1H) ; 4.17 (q,2H) ; 7.15 (m,1H) ; 7.28 (s,1H) ; 7.41 (m,3H). |
| 1.2-96 | [CDCl ₃] 1.24-1.32 (m,6H) ; 2.57 (m,2H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.84 (d,1H) ; 4.12-4.20 (m,2H) ; 4.37-4.44 (m,1H) ; 7.14 (m,1H) ; 7.41 (m,3H). |
| 1.2-102 | [CDCl ₃] 1.88-1.95 (quint,2H) ; 2.40 (t,2H) ; 3.37-3.43 (m,6H) ; 3.69 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 6.94 (s,1H) ; 7.15 (m,1H) ; 7.41 (m,3H). |
| 1.2-119 | [CDCl ₃] 3.38 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.96 (d,1H) ; 4.62 (m,2H) ; 7.17 (m,1H) ; 7.28 (s,1H) ; 7.41 (m,3H) ; 7.68 (d,1H) ; 7.86 (d,1H) ; 8.69 (s,1H). |
| 1.2-138 | [CDCl ₃] 3.39 (s,3H), 3.44 (d,1H), 3.99 (d,1H) ; 4.47-4.58 (m,2H) ; 7.19 (m,3H) ; 7.43 (m,4H) ; 8.34 (d,1H). |
| 1.2-142 | [CDCl ₃] 3.39 (s,3H) ; 3.42 (d,1H), 3.93 (s,3H) ; 3.93 (d,1H) ; 4.42-4.56 (m,2H) ; 6.65 (s,1H) ; 6.30 (d,1H) ; 7.13-7.20 (m,2H) ; 7.43 (m,3H) ; 8.13 (d,1H). |
| 1.2-147 | [CDCl ₃] 2.58 (s,3H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.95 (d,1H), 4.51 (m,2H) ; 7.05 (s,1H) ; 7.10 (s,1H) ; 7.18 (m,2H) ; 7.41 (m,3H) ; 7.48 (d,1H). |
| 1.2-148 | [CDCl ₃] 1.30 (t,3H) ; 2.83 (q,2H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.95 (d,1H) ; 4.51 (m,2H) ; 7.05 (d,1H) ; 7.09 (s,1H) ; 7.17 (m,2H) ; 7.42 (m,3H) ; 8.50 (d,1H). |
| 1.2-149 | [CDCl ₃] 1.01 (m,4H) ; 2.03 (m,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.97 (d,1H) ; 4.50 (m,2H) ; 6.95 (d,1H) ; 7.06 (s,1H) ; 7.17 (m,2H) ; 7.41 (m,3H) ; 8.40 (d,1H). |
| 1.2-150 | [CDCl ₃] 0.97 (t,3H) ; 1.70-1.80 (m,2H) ; 2.78 (t,2H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.94 (d,1H) ; 4.51 (m,2H) ; 7.05 (d,1H) ; 7.08 (s,1H) ; 7.18 (m,2H) ; 7.41 (m,3H) ; 8.50 (d,1H). |
| 1.2-200 | [CDCl ₃] 2.46 (s,3H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.88 (d,1H) ; 4.22-4.38 (m,2H) ; 7.01 (s br,1H) ; 7.11-7.20 (m,1H) ; 7.42 (m,3H) ; 8.20 (s,1H). |
| 1.2-201 | [CDCl ₃] 2.27 (s,3H) ; 2.42 (s,3H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.93 (d,1H) ; 4.27 (m,2H) ; 6.81 (s,1H) ; 7.17 (m, 1H) ; 7.41 (m, 3H). |
| 1.2-202 | [CDCl ₃] 1.30 (t,3H) ; 2.42 (s,3H) ; 2.66 (q,2H) ; 3.34 (s,3H), 3.40 (d,1H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.28 (m,2H) ; 6.80 (s,1H) ; 7.17 (m,1H) ; 7.41 (m,3H). |
| 1.2-203 | [CDCl ₃] 1.30 (m,6H) ; 2.66 (q,2H) ; 2.79 (q,2H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.28 (m,2H) ; 6.79 (s,1H) ; 7.16 (m,1H) ; 7.42 (m,3H). |
| 1.2-206 | [CDCl ₃] 1.48 (t,3H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.14 (q,2H) ; 4.38 (m,2H) ; 6.96 (s,1H) ; 7.16 (m,1H) ; 7.40 (m,4H) ; 7.46 (s,1H). |
| 1.2-207 | [CDCl ₃] 3.35 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.90 (d,1H) ; 4.37-4.43 (m,2H) ; 4.68 (q,2H) ; 7.02 (s,1H) ; 7.18 (m,1H) ; 7.41 (m,3H) ; 7.53 (s,1H) ; 7.56 (s,1H). |
| 1.2-210 | [CDCl ₃] 1.02 (m,2H) ; 1.11 (m,2H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.57 (m,1H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.36 (m,2H) ; 6.95 (s,1H) ; 7.17 (m,1H) ; 7.39-7.56 (m,5H). |

| 編號 | NMR |
|---------|--|
| 1.2-211 | [CDCl ₃] 2.24 (s,3H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.81 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 4.26-4.38 (m,2H) ; 6.83 (s br,1H) ; 7.15 (m,1H) ; 7.28 (s,1H) ; 7.40 (m,3H). |
| 1.2-212 | [CDCl ₃] 1.46 (t,3H) ; 2.26 (s,3H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 4.09 (q,2H) ; 4.27-4.39 (m,2H) ; 6.83 (s br,1H) ; 7.16 (m,1H) ; 7.32 (s,1H) ; 7.41 (m,3H). |
| 1.2-241 | [CDCl ₃] 3.40 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.97(d,1H) ; 4.56-4.68 (m,2H) ; 6.95(s,1H) ; 7.16 (m,1H) ; 7.28 (s br,1H) ; 7.92 (m,3H) ; 8.19 (s,1H). |
| 1.2-257 | [CDCl ₃] 1.42 (t,3H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.81(d,1H) ; 3.91 (s,3H) ; 3.96 (q,2H) ; 4.20-4.32 (m,2H) ; 7.03 (s br,1H) ; 7.15 (m,1H) ; 7.20 (s,1H) ; 7.40 (m,3H). |
| 1.2-258 | [CDCl ₃] 3.35 (s,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.71 (s,3H) ; 3.82 (d,1H) ; 3.90 (s,3H) ; 4.25 (d,1H) ; 7.03 (s br,1H) ; 7.15 (m,1H) ; 7.17 (s,1H) ; 7.40 (m,3H). |

分析數據表 1.3

| 編號 | NMR |
|---------|--|
| 1.3-1 | [CDCl ₃] 3.41 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.88 (d,1H) ; 5.85 (s,1H) ; 6.72 (s,1H) ; 7.38 (t,1H) ; 7.41 (d,1H) ; 7.53 (d,1H) ; 7.69 (s,1H). |
| 1.3-9 | [CDCl ₃] 3.39-3.46 (m,4H) ; 3.85-3.94 (m,2H) ; 4.06-4.14 (m,1H) ; 7.07 (s,1H) ; 7.38 (m,1H) ; 7.43 (m,1H) ; 7.56 (m,1H) ; 7.69 (m,1H). |
| 1.3-16 | [CDCl ₃] 3.38 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.89 (d,1H) ; 3.90-4.03 (m,2H) ; 5.18-5.27 (m,2H) ; 5.80-5.91 (m,1H) ; 6.86 (s,1H) ; 7.37 (m,1H) ; 7.42 (m,1H) ; 7.52 (m,1H) ; 7.69 (s,1H). |
| 1.3-60 | [CDCl ₃] 0.60 (m,2H) ; 0.85 (m,2H) ; 2.82 (m,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 6.81 (s,1H) ; 7.37 (t,1H) ; 7.42 (d,1H) ; 7.53 (d,1H) ; 7.69 (s,1H). |
| 1.3-94 | [CDCl ₃] 1.28 (m,3H) ; 2.60 (t,2H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.62 (m,2H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.18 (q,2H) ; 7.31 (s,1H) ; 7.38 (t,1H) ; 7.41 (d,1H) ; 7.53 (d,1H) ; 7.68 (s,1H). |
| 1.3-96 | [CDCl ₃] 1.22-1.30 (m,6H) ; 2.52-2.60 (m,2H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.11-4.20 (m,2H) ; 4.40 (m,1H) ; 7.25 (s,1H) ; 7.36 (t,1H) ; 7.43 (d,1H) ; 7.52 (d,1H) ; 7.68 (s,1H). |
| 1.3-102 | [CDCl ₃] 1.92 (quint,2H) ; 2.40 (t,2H) ; 3.35-3.43 (m,6H) ; 3.69 (s,3H) ; 3.88 (d,1H) ; 6.93 (s,1H) ; 7.31-7.43 (m,2H) ; 7.52 (d,1H) ; 7.68 (s,1H). |
| 1.3-110 | [CDCl ₃] 3.36 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.52 (m,2H) ; 7.18 (s,1H) ; 7.31-7.77 (m,3H) ; 7.52 (m,1H) ; 7.67 (m, 2H) ; 8.35 (s,1H). |
| 1.3-206 | [CDCl ₃] 1.48 (t,3H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.88 (d,1H) ; 4.14 (q,2H), 4.38 (m,2H) ; 6.95 (s,1H) ; 7.36-7.46 (m,4H) ; 7.53 (m,1H) ; 7.68 (s,1H). |
| 1.3-212 | [CDCl ₃] 1.46 (t,3H) ; 2.25 (s,3H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.38 (d,1H) ; 3.88 (d,1H) ; 4.08 (m,2H) ; 4.32 (m,2H) ; 6.81 (s,1H) ; 7.31 (s,1H) ; 7.38 (t,1H) ; 7.41 (t,1H) ; 7.53 (d,1H) ; 7.68 (s,1H). |

分析數據表 1.5

| 編號 | NMR |
|----|-----|
|----|-----|

| 編號 | NMR |
|---------|--|
| 1.5-1 | [CDCl ₃] 2.39 (s,3H) ; 3.41 (s,3H) ; 3.46 (d,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 5.73 (s br,1H) ; 6.72 (s br,1H) ; 7.27 (d,1H) ; 7.32 (t,1H) ; 7.44 (d,1H) ; 7.51 (s,1H). |
| 1.5-9 | [CDCl ₃] 2.39 (s,3H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.47 (d,1H) ; 3.88 (d,1H) ; 3.82-3.97 (m,1H) ; 4.02-4.17 (m,1H) ; 7.10 (s br,1H) ; 7.25 (d,1H) ; 7.31 (t,1H) ; 7.44 (d,1H) ; 7.52 (s,1H). |
| 1.5-16 | [CDCl ₃] 2.39 (s,3H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.45 (d,1H) ; 3.87 (d,1H) ; 3.90-4.07 (m,2H) ; 5.20 (d,1H) ; 5.24 (d,1H) ; 5.81-5.92 (m,1H) ; 6.89 (s br,1H) ; 7.25 (d,1H) ; 7.31 (t,1H) ; 7.45 (d,1H) ; 7.51 (1H). |
| 1.5-60 | [CDCl ₃] 0.54-0.64 (m,2H) ; 0.79 -0.87 (m,2H) ; 2.38 (s,3H) ; 2.77-2.86 (m,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 6.83 (s br,1H) ; 7.25 (d,1H) ; 7.31 (t,1H) ; 7.43 (d,1H) ; 7.50 (s,1H). |
| 1.5-94 | [CDCl ₃] 1.27 (t,3H) ; 2.38 (s,3H) ; 2.59 (t,2H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.57-3.66 (m,2H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.17 (q,2H) ; 7.21-7.33 (3H) ; 7.44 (d,1H) ; 7.51 (s,1H). |
| 1.5-96 | [CDCl ₃] D 1 : 1.26 (t,3H) ; 1.30 (d,3H) ; 2.38 (s,3H) ; 2.55 (d,2H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.83 (d,1H) ; 4.15 (q,2H) ; 4.33-4.46 (m,1H) ; 7.22 (s br,1H) ; 7.25 (d,1H) ; 7.31 (t,1H) ; 7.45 (d,1H) ; 7.51 (s,1H). D 2 : 1.27 (t,3H) ; 1.30 (d,3H) ; 2.38 (s,3H) ; 2.57 (d,2H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.84 (d,1H) ; 4.16 (q,2H) ; 4.33-4.46 (m,1H) ; 7.22 (s br,1H) ; 7.25 (d,1H) ; 7.31 (t,1H) ; 7.45 (d,1H) ; 7.51 (s,1H). |
| 1.5-102 | [CDCl ₃] 1.91 (pent,2H) ; 2.38 (q,2H) ; 2.39 (s,3H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.30-3.43 (m,2H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.67 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 6.94 (s br,1H) ; 7.25 (d,1H) ; 7.31 (t,1H) ; 7.44 (d,1H) ; 7.51 (s,1H). |
| 1.5-206 | [CDCl ₃] 1.48 (t,3H) ; 2.38 (s,3H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.43 (d,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.14 (q,2H) ; 4.31-4.42 (m,2H) ; 6.97 (s br,1H) ; 7.25 (d,1H) ; 7.31 (t,1H) ; 7.40 s,1H) ; 7.44 (d,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.50 (s,1H). |
| 1.5-212 | [CDCl ₃] 1.26 (t,3H) ; 2.24 (s,3H) ; 2.38 (s,3H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.43 (d,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.06 (q,2H) ; 4.25-4.38 (m,2H) ; 6.83 (s br,1H) ; 7.25 (d,1H) ; 7.31 (t,1H) ; 7.44 (d,1H) ; 7.50 (s,1H). |

分析數據表 1.6

| 編號 | NMR |
|--------|--|
| 1.6-1 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 2.68 (q,2H) ; 4.41 (s,3H) ; 3.47 (d,1H) ; 3.88 (d,1H) ; 5.66 (s br,1H) ; 6.72 (s br,1H) ; 7.29 (d,1H) ; 7.34 (t,1H) ; 7.45 (d,1H) ; 7.54 (s,1H). |
| 1.6-9 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 2.68 (q,2H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.47 (d,1H) ; 3.82-3.97 (m,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.02-4.16 (m,1H) ; 7.09 (s br,1H) ; 7.28 (d,1H) ; 7.34 (t,1H) ; 7.45 (d,1H) ; 7.53 (s,1H). |
| 1.6-16 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 2.68 (q,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.45 (d,1H) ; 3.87 (d,1H) ; 3.90-4.04 (m,2H) ; 5.18 (d,1H) ; 5.24 (d,1H) ; 5.81-5.92 (m,1H) ; 6.88 (s br,1H) ; 7.29 (d,1H) ; 7.33 (t,1H) ; 7.44 (d,1H) ; 7.54 (s,1H). |
| 1.6-60 | [CDCl ₃] 0.59 (m,2H) ; 0.84 (m,2H) ; 1.25 (t,3H) ; 2.68 (q,2H) ; 2.81-2.84 (m,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.43 (d,1H) ; 3.87 (d,1H) ; 6.85 (s br,1H) ; 2.27 (d,1H) ; 7.33 (t,1H) ; 7.44 (d,1H) ; 7.53 (s,1H). |

| 編號 | NMR |
|---------|---|
| 1.6-94 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 1.28 (t,3H) ; 2.59 (m,2H) ; 2.67 (q,2H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.58-3.66 (m,2H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.17 (q,2H) ; 7.27 (d,1H) ; 7.30 (s br,1H) ; 7.34 (t,1H) ; 7.44 (d,1H) ; 7.54 (s,1H). |
| 1.6-96 | [CDCl ₃] 1.23-1.33 (m,6H) ; 2.51-2.63 (m,2H) ; 2.68 (q,2H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.43 (d,1H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.12-4.20 (m,2H) ; 4.36-4.44 (m,1H) ; 7.25 (t br,1H) ; 7.27 (d,1H) ; 7.34 (t,1H) ; 7.44 (d,1H) ; 7.54 (s,1H). |
| 1.6-110 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 2.68 (q,2H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.44 (d,1H) ; 3.91 (d,1H) ; 4.46-4.58 (m,2H) ; 7.19 (t br,1H) ; 7.27-7.37 (m,3H) ; 7.45 (d,1H) ; 7.53 (s,1H) ; 7.64 (d,1H) ; 8.35 (s,1H). |
| 1.6-206 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 1.48 (t,3H) ; 2.68 (q,2H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.44 (d,1H) ; 4.14 (q,2H) ; 4.31-4.43 (m,2H) ; 6.96 (s br,1H) ; 7.29 (d,1H) ; 7.33 (t,1H) ; 7.40 (s,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.54 (s,1H). |
| 1.6-212 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 1.45 (t,3H) ; 2.26 (s,3H) ; 2.67 (q,2H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.44 (d,1H) ; 3.87 (d,1H) ; 4.08 (q,2H) ; 4.28-4.37 (m,2H) ; 6.85 (s br,1H) ; 7.27 (d,1H) ; 7.33 (s,1H) ; 7.34 (t,1H) ; 7.44 (d,1H) ; 7.53 (s,1H). |

分析數據表 1.7

| 編號 | NMR |
|---------|--|
| 1.7-1 | [CDCl ₃] 3.41 (s,3H) ; 3.46 (d,1H) ; 3.84 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 5.79 (s br,1H) ; 6.72 (s br,1H) ; 7.00 (d,1H) ; 7.18 (d,1H) ; 7.26 (s,1H) ; 7.34 (t,1H). |
| 1.7-9 | [CDCl ₃] 3.39 (s,3H) ; 3.45 (d,1H) ; 3.86 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 3.86-3.95 (m,1H) ; 4.01-4.18 (m,1H) ; 7.01 (d,1H) ; 7.09 (s br,1H) ; 7.18 (d,1H) ; 7.26 (s,1H) ; 7.34 (t,1H). |
| 1.7-16 | [CDCl ₃] 3.38 (s,3H) ; 3.43 (d,1H) ; 3.84 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 3.80-4.06 (m,2H) ; 5.19 (d,1H) ; 5.25 (d,1H) ; 5.81-5.90 (m,1H) ; 6.88 (s br,1H) ; 7.00 (d,1H) ; 7.17 (d,1H) ; 7.26 (s,1H) ; 7.33 (t,1H). |
| 1.7-60 | [CDCl ₃] 0.59 (m,2H) ; 0.84 (m,2H) ; 2.82 (m,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.84 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 6.85 (s br,1H) ; 7.00 (d,1H) ; 7.17 (d,1H) ; 7.26 (s,1H) ; 7.33 (t,1H). |
| 1.7-94 | [CDCl ₃] 1.28 (t,3H) ; 2.60 (t,2H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.57-3.68 (m,2H) ; 3.84 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.16 (q,2H) ; 6.69 (d,1H) ; 7.18 (d,1H) ; 7.30 (s br,1H) ; 7.31 (t,1H). |
| 1.7-96 | [CDCl ₃] D1 : 1.24 (t,3H) ; 1.29 (d,3H) ; 2.55 (m,2H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.85 (s,3H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.10-4.20 (m,2H) ; 4.35-4.43 (m,1H) ; 6.99 (d,1H) ; 7.18 (d,1H) ; 7.25 (s,1H) ; 7.26 (s br,1H) ; 7.33 (t,1H). D2 : 1.26 (t,3H) ; 1.30 (d,3H) ; 2.58 (m,2H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.85 (s,3H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.10-4.20 (m,2H) ; 4.35-4.43 (m,1H) ; 6.99 (d,1H) ; 7.18 (d,1H) ; 7.25 (s,1H) ; 7.26 (s br,1H) ; 7.33 (t,1H). |
| 1.7-110 | [CDCl ₃] 3.36 (s,3H) ; 3.43 (d,1H) ; 3.84 (s,3H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.47-4.56 (m,2H) ; 7.00 (d,1H) ; 7.18 (d,1H) ; 7.23 (t br,1H) ; 7.25 (s,1H) ; 7.33 (t,1H) ; 7.34 (d,1H) ; 7.66 (d,1H) ; 8.35 (s,1H). |
| 1.7-206 | [CDCl ₃] 1.48 (t,3H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.43 (d,1H) ; 3.84 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 4.15 (q,2H) ; 4.33-4.42 (m,2H) ; 6.97 (s br,1H) ; 7.00 (d,1H) ; 7.18 (d,1H) ; 7.26 (s,1H) ; 7.33 (t,1H) ; 7.41 (s,1H) ; 7.46 (s,1H). |

| 編號 | NMR |
|---------|---|
| 1.7-212 | [CDCl ₃] 1.46 (t,3H) ; 2.26 (s,3H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.84 (s,3H) ; 3.88 (d,1H) ; 4.08 (q,2H) ; 4.29-4.37 (m,2H) ; 6.85 (s br,1H) ; 7.01 (d,1H) ; 7.17 (d,1H) ; 7.26 (s,1H) ; 7.33 (s,1H) ; 7.36 (t,1H). |

分析數據表 1.11

| 編號 | NMR |
|---------------|--|
| 1.11-4 | [CDCl ₃] 0.96 (t,3H) ; 1.54-1.66 (m,2H) ; 3.22-3.38 (m,2H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.83 (d,1H) ; 6.78 (s br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-7 | [CDCl ₃] D1 : 0.93 (t,3H) ; 1.19 (d,3H) ; 1.52 (m,2H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.81(d,1H) ; 3.96 (m,1H) ; 6.55 (d,br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.19 (d,2H). D2 : 0.95 (t,3H) ; 1.20 (d,3H) ; 1.52 (m,2H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.83(d,1H) ; 3.96 (m,1H) ; 6.55 (d br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.19 (d,2H). |
| 1.11-8 | [CDCl ₃] D1 : 0.92 (d,6H) ; 1.14 (d,3H) ; 1.75 (sept,1H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.80 (d,1H) ; 3.86-3.94 (m,1H) ; 6.60 (d br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H). D2 : 0.96 (d,6H) ; 1.15 (d,3H) ; 1.75 (sept,1H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.83 (d,1H) ; 3.86-3.94 (m,1H) ; 6.60 (d br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-9 | [CDCl ₃] 3.39 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 3.84-3.96 (m,1H) ; 4.04-4.16 (m,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.1 (t br,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-10 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.61-3.87 (m,2H) ; 3.86 (d,1H) ; 5.91 (tt,1H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.04 (t br,1H) ; 7.21 (d,1H). |
| 1.11-11 | [CDCl ₃] 3.38 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 3.88-4.03 (m,1H) ; 4.06-4.22(m,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.03 (s br,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-15 | [CDCl ₃] 2.62-2.80 (m,2H) ; 3.36(d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.55-3.72 (m,2H) ; 3.88 (d,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.18 (s br,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-16 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 3.90-4.06 (m,2H) ; 5.20 (d,1H) ; 5.25 (d,1H) ; 5.81-5.92 (m,1H) ; 6.86 (s br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-19 D1 | [CDCl ₃] D1 : 1.25 (d,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.40 (s,3H) ; 3.35-3.44 (m,2H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.82 (d,1H) ; 4.20 (m,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 6.94 (d br,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-19 D2 | [CDCl ₃] D2 : 1.24 (d,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.41 (m,2H) ; 3.82 (d,1H) ; 4.21 (m,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 6.91(d br,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-20 | [CDCl ₃] D1 : 1.43 (d,3H) ; 2.55-2.66 (m,1H) ; 2.73-2.90 (m, 1H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.37 (s,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.23-4.32 (m,1H) ; 6.84 (t br,1H) ; 6.90 (t br,1H) ; 7.20 (d,2H). D2 : 1.44 (d,3H) ; 2.55-2.66 (m,1H) ; 2.73-2.90 (m, 1H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.37 (s,1H) ; 3.88 (d,1H) ; 4.23-4.32 (m,1H) ; 6.84 (t br,1H) ; 6.90 (t br,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-21 | [CDCl ₃] 1.10-1.19 (m,7H) ; 1.20-1.28 (m,1H) ; 3.30-3.45 (m,8H) ; 3.74-3.86 (m,1H) ; 4.00-4.13(m,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.04 (t br,1H) ; 7.19 (d,2H). |
| 1.11-24 | [CDCl ₃] 3.00 (s,3H) ; 3.23-3.39 (m,2H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.80-3.94 (m,2H) ; 3.90 (d,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.41 (t br,1H). |
| 1.11-25 | [CDCl ₃] 1.28 (t,3H) ; 2.58 (quart,2H) ; 2.73 (t,2H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.48-3.63 (m,2H) ; 3.85 (d,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.13 (s br,1H) ; 7.21 (d,2H). |

| 編號 | NMR |
|---------------|--|
| 1.11-40 | [CDCl ₃] 3.37 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.19-4.39 (m,2H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.18 (s br,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-41 D2 | [CDCl ₃] D2 : 1.65 (d,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.90-5.00 (m,1H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.07 (s br,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-41 D1 | [CDCl ₃] D1 : 1.64 (d,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.94 (d,1H) ; 4.88-4.98 (m,1H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.04 (s br,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-42 | [CDCl ₃] 1.78 (s,6H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.96 (d,1H) ; 6.82 (s,1H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-45 | [CDCl ₃] D1 : 1.11 (t,3H) ; 1.73 (s,3H) ; 1.90-2.19 (m,2H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.94 (d,1H) ; 6.28 (d br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H). D2 : 1.15 (t,3H) ; 1.74 (s,3H) ; 1.90-2.19 (m,2H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.97 (d,1H) ; 6.28 (d br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-46 D1 | [CDCl ₃] D1 : 1.04 (t,3H) ; 1.50-1.63 (m,2H) ; 1.75 (s,3H) ; 1.82-2.06 (m,2H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.97 (d,1H) ; 6.82 (s br,1H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.21 (d,2H). |
| 1.11-46 D2 | [CDCl ₃] D2 : 1.01 (t,3H) ; 1.48-1.60 (m,2H) ; 1.74 (s,3H) ; 1.85-1.88 (m,1H) ; 2.01-2.11 (m,1H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.96 (d,1H) ; 6.79 (s br,1H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.21 (d,2H). |
| 1.11-47 | [CDCl ₃] D1 : 0.75 (m,4H) ; 1.31(m,1H) ; 1.83 (s,3H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.91 (d,1H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.01 (s br,1H) ; 7.20 (d,1H). D2 : 0.75 (m,4H) ; 1.31(m,1H) ; 1.82 (s,3H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.99 (d,1H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.01 (s br,1H) ; 7.20 (d,1H). |
| 1.11-48 D1 | [CDCl ₃] D1 : 1.41 (d,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.80 (d,1H) ; 4.65-4.79 (m,1H) ; 6.83 (d br,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-48 D2 | [CDCl ₃] D2 : 1.40 (d,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 4.66-4.78 (m,1H) ; 6.87 (d br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-49 D1 | [CDCl ₃] D1 1.04 (t,3H) ; 1.54-1.68 (m,1H) ; 1.90- 2.01(m,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.77 (d,1H) ; 4.46-4.60 (m,1H) ; 6.7 (d br,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-49 D2 | [CDCl ₃] D2 : 1.02 (t,3H) ; 1.55-1.68 (m,1H) ; 1.89- 2.00(m,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.47-4.60 (m,1H) ; 6.75 (d br,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-50 | [CDCl ₃] D1 : 1.02 (m,6H) ; 2.16-2.28 (m,1H) ; 3.38 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.78 (d,1H) ; 4.46-4.59 (m,1H) ; 6.83 (d br,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.21 (d,2H). D2 : 1.05 (m,6H) ; 2.16-2.28 (m,1H) ; 3.43 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.46-4.59 (m,2H) ; 6.88 (d br,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.21 (d,2H). |
| 1.11-51 | [CDCl ₃] 1.58-1.69 (m,1H) ; 1.34-1.98 (m,2H) ; 2.05-2.15 (m,1H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.81-3.96 (m, 2H) ; 3.95 (d,1H) ; 4.25-4.33 (m,1H) ; 4.57-4.68 (m,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.21 (d,2H) ; 7.21 (s br,1H). |
| 1.11-53 | [CDCl ₃] D1 : 1.47 (d,3H) ; 2.31 (d,1H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.81 (d,1H) ; 4.78-4.88 (m,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 6.95 (s br,1H) ; 7.20 (d,2H). D2 : 1.50 (d,3H) ; 2.32 (d,1H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.78-4.88 (m,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 6.95 (s br,1H) ; 7.20 (d,2H). |

| 編號 | NMR |
|----------|--|
| 1.11-55 | [CDCl ₃] D1 : 1.41 (d,3H) ; 1.82 (d,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.80 (d,1H) ; 4.72-4.82 (m,1H) ; 6.86-6.94 (m,2H) ; 7.20 (d,2H). D2 : 1.44 (d,3H) ; 1.82 (d,3H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.72-4.82 (m,1H) ; 6.86-6.94 (m,2H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-58 | [CDCl ₃] D1 : 1.19 (d,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.38(s,3H) ; 3.43 (s,3H) ; 3.46 (s,3H) ; 3.80 (d,1H) ; 4.16-4.28 (m,2H) ; 6.85 (s br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H). D2 : 1.21 (d,3H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.38(s,3H) ; 3.44 (s,3H) ; 3.46 (s,3H) ; 3.81 (d,1H) ; 4.16-4.28 (m,2H) ; 6.85 (s br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-59 | [CDCl ₃] D1 : 1.12 (t,3H) ; 1.42 (d,3H) ; 2.44-2.69 (m,2H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.81 (d,1H) ; 4.59-4.68 (m,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.45 (d br,1H). D2 : 1.13 (t,3H) ; 1.41 (d,3H) ; 2.44-2.69 (m,2H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 4.59-4.68 (m,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.45 (d br,1H). |
| 1.11-60 | [CDCl ₃] 0.56-0.63 (m,2H) ; 0.82-0.88 (m,2H) ; 2.78-2.86 (m,1H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.85 (d,1H) ; 6.80 (s br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-62 | [CDCl ₃] D1 : 0.22-0.32 (m,2H) ; 0.43-0.54 (m,2H) ; 0.83-0.93 (m,1H) ; 1.27 (d,3H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.38-3.48 (m,1H) ; 3.81 (d,1H) ; 6.26 (s br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.21 (d,2H). D2 : 0.32-0.43 (m,2H) ; 0.54-0.63 (m,2H) ; 0.83-0.93 (m,1H) ; 1.28 (d,3H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.38-3.48 (m,1H) ; 3.82 (d,1H) ; 6.26 (s br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.21 (d,2H). |
| 1.11-64 | [CDCl ₃] 1.29-1.40 (m,2H) ; 1.57-1.68 (m,2H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.96 (d,1H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.24 (s br,1H). |
| 1.11-70 | [CDCl ₃] 3.19-3.28 (m,2H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.90 (d,1H) ; 4.10-4.19 (m,2H) ; 4.40-4.54 (m,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.23 (d br,1H) ; 7.21(d,2H). |
| 1.11-71 | [CDCl ₃] 3.32 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.02-4.11 (m,2H) ; 4.54-4.62 (m,2H) ; 4.71-4.80 (m,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.37 (d br,1H). |
| 1.11-73 | [CDCl ₃] 1.83 -1.92 (m,1H) ; 2.26-2.38 (m,1H) ; 3.33 (dd,1H) ; 3.36 (s(3H) ; 3.70-3.76 (m,1H) ; 3.78-3.91(m,3H) ; 3.94-4.02(m,1H) ; 4.51-4.61 (m,1H) ; 6.91 (t, 1H) ; 6.94 (s br,1H) ; 7.21 (d,2H). |
| 1.11-74 | [CDCl ₃] 1.60-1.70 (m,1H) ; 2.02-2.13 (m,1H) ; 2.48-2.60 (m,1H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.32-3.44 (m,1H) ; 3.54-3.58 (m,1H) ; 3.71-3.95 (m, 3H) ; 3.85 (d,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 6.91(s br,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-76 | [CDCl ₃] D1 : 0.92 (t,3H) ; 1.18 (d,3H) ; 1.29-1.43 (m,2H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.81 (d,1H) ; 3.97-4.10 (m,1H) ; 6.53 (d br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.21 (d,2H). D2 : 0.94 (t,3H) ; 1.20 (d,3H) ; 1.43-1.53 (m,2H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.83 (d,1H) ; 3.97-4.10 (m,1H) ; 6.53 (d br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.21 (d,2H). |
| 1.11-93 | [CDCl ₃] 2.61 (t,2H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.62 (q,2H) ; 3.72 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 2.29 (s br,1H). |
| 1.11-96 | [CDCl ₃] D1 : 1.25 (t,3H) ; 1.30 (d,3H) ; 2.50-2.62 (m,2H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.83 (d,1H) ; 4.17 (q,2H) ; 4.40 (m,1H) ; 6.91 t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.25 (s br,1H). D2 : 1.26 (t,3H) ; 1.31 (d,3H) ; 2.50-2.62 (m,2H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 4.18 (q,2H) ; 4.40 (m,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.25 (s br,1H) |
| 1.11-102 | [CDCl ₃] 1.92 (pent,2H) ; 2.40 (t,2H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.38-3.42 (m,2H) ; 3.69 (s,3H) ; 3.85 (d,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 6.94 (s br,1H) ; 7.20 (d,2H). |

| 編號 | NMR |
|----------|--|
| 1.11-110 | [CDCl ₃] 3.35 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.49-4.56 (m,2H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.19 (d,2H) ; 7.33 (d,1H) ; 7.65 (d,1H) ; 8.35 (s,1H). |
| 1.11-111 | [CDCl ₃] 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.45-4.58 (m,2H) ; 6.88-6.96 (m,2H) ; 7.18 (s br,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.79 (m,1H) ; 8.18 (s,1H). |
| 1.11-113 | [CDCl ₃] 3.35 (d,1H), 3.35 (s,3H) ; 3.88 (d,1H) ; 3.93 (s,3H) ; 4.40-4.52 (m,2H) ; 6.73 (d,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.04 (t br,1H) ; 7.20 (d,1H) ; 7.56 (dd,1H) ; 8.11 (d,1H). |
| 1.11-119 | [CDCl ₃] 3.35 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 4.58 - 4.67 (m,2H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.22 (s br,1H) ; 7.68 (d,1H) ; 7.84 (d,1H) ; 8.69 (s,1H). |
| 1.11-135 | [CDCl ₃] 3.37 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.95 (d,1H) ; 4.49-4.61 (m,2H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.28 (s,2H) ; 8.59 (s,2H). |
| 1.11-136 | [CDCl ₃] 3.37 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.97 (d,1H) ; 4.51 - 4.62 (m,2H) ; 6.87 (s,1H) ; 6.93 (t,1H) ; 7.12 (d,1H) ; 7.22 (d,2H) ; 7.25 (s br,1H) ; 8.20 (d,1H). |
| 1.11-137 | [CDCl ₃] 3.37 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.97 (d,1H) ; 4.51 - 4.62 (m,2H) ; 6.87 (s,1H) ; 6.93 (t,1H) ; 7.12 (d,1H) ; 7.22 (d,2H) ; 7.25 (s br,1H) ; 8.20 (d,1H). |
| 1.11-138 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.97 (d,1H) ; 4.44-4.59 (m,2H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.19 (d,1H) ; 7.20 (s br,1H), 7.20 (d,2H) ; 7.42 (s,1H) ; 8.34 (d,1H). |
| 1.11-142 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.92 (d,1H) ; 3.93 (s,3H) ; 4.42-4.56 (m,2H) ; 6.65 (s,1H) ; 6.79 (d,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.12 (t br,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 8.13 (d,1H). |
| 1.11-147 | [CDCl ₃] 2.56 (s,3H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.95 (d,1H) ; 4.43-4.58 (m,2H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.02 (d,1H) ; 7.08 (s,1H) ; 7.16 (t br,1H) ; 7.21 (d,2H) ; 8.47 (d,1H). |
| 1.11-148 | [CDCl ₃] 1.31 (t,3H) ; 2.83 (q,2H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.94 (d,1H) ; 4.45-4.58 (m,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.03 (d,1H) ; 7.08 (s,1H) ; 7.16 (s br,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 8.50 (d,1H). |
| 1.11-149 | [CDCl ₃] 1.21 (m,2H) ; 1.42 (m,2H) ; 2.57 (m,1H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 4.01 (d,1H) ; 4.55-4.73 (m,2H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.15 (s,1H) ; 7.22 (d,2H) ; 7.41(d,1H) ; 7.63 (t br,1H) ; 8.57 (d,1H). |
| 1.11-150 | [CDCl ₃] 0.97 (t,3H) ; 1.70-1.82 (m,2H) ; 2.77 (t,2H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.94 (d,1H) ; 4.44-4.58 (m,2H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.04 (d,1H) ; 7.07 (s,1H) ; 7.16 (t br,1H) ; 7.21 (d,2H) ; 8.50 (d,1H). |
| 1.11-152 | [CDCl ₃] 3.37 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.97 (d,1H) ; 4.55-4.69 (m,2H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.21 (d,2H) ; 7.30 (t br,1H) ; 7.44 (d,1H) ; 7.60 (s,1H) ; 8.71 (d,1H). |
| 1.11-179 | [CDCl ₃] 3.41 (d,1H) ; 3.44 (s,3H) ; 3.88 (d,1H) ; 4.74-4.86 (m,2H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.22 (d,2H) ; 7.97 (s,1H) ; 8.20 (s br,1H) ; 8.76 (s,1H). |
| 1.11-180 | [CDCl ₃] 3.26 (t,2H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.33 (s,3H) ; 3.80 (d,1H) ; 3.84-3.92 (m,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.52 (s br,1H) ; 7.91 (s,1H) ; 8.72 (s,1H). |
| 1.11-189 | [CDCl ₃] 2.48 (s,6H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.46 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.62-4.73 (m,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.21 (d,2H) ; 8.04 (s br,1H). |
| 1.11-191 | [CDCl ₃] 3.40 (d,1H) ; 3.43 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 3.95 (s,6H) ; 4.51-4.15 (m,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.95 (s br,1H). |
| 1.11-194 | [CDCl ₃] 3.39 (d,1H) ; 3.42 (s,3H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.65 (m,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.21 (d,2H) ; 7.32 (d,1H) ; 7.84 (br,1H) ; 8.71 (d,1H) ; 9.20 (s,1H). |

| 編號 | NMR |
|----------|--|
| 1.11-197 | [CDCl ₃] 2.29 (s,3H) ; 2.38 (s,3H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.83 (d,1H) ; 4.28 (d,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.19 (s br,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-199 | [CDCl ₃] 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.34-4.47 (m,2H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.09 (t br,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 8.31 (s,1H) ; 8.45 (s,1H). |
| 1.11-200 | [CDCl ₃] 2.46 (s,3H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.34 (s, 3H) ; 3.87 (d,1H) ; 4.24 - 4.37 (m,2H) ; 6.91 (t,1H) ; 6.93 (t br,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-201 | [CDCl ₃] 2.26 (s,3H) ; 2.42 (s,3H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.26 (m,2H) ; 6.8 (s br,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.19 (d,1H). |
| 1.11-202 | [CDCl ₃] 1.30 (t,3H) ; 2.42 (s,3H) ; 2.65 (q,2H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.90 (d,1H) ; 4.21-4.33 (m,2H) ; 6.77 (t br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 1.11-203 | [CDCl ₃] 1.29 (t,3H) ; 1.30 (t,3H) ; 2.66 (q,2H) ; 2.79 (q,2H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.80 (d,1H) ; 4.22-4.33 (m,2H) ; 6.26 (s,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.19 (d,2H). |
| 1.11-206 | [CDCl ₃] 1.48 (t,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.15 (q,2H) ; 4.33-4.43 (m,2H) ; 6.88 (t,1H) ; 6.94 (s br,1H) ; 7.18 (d,2H) ; 7.41 (s,1H) ; 7.46 (s,1H). |
| 1.11-207 | [CDCl ₃] 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 4.33-4.46 (m,2H) ; 4.69 (q,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.02 (t br,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.53 (s,1H) ; 7.56 (s,1H). |
| 1.11-208 | [CDCl ₃] 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 4.32-4.48 (m,2H) ; 6.07 (tt,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 6.98 (t br,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.48 (s,1H) ; 7.54 (s,1H). |
| 1.11-210 | [CDCl ₃] 0.98-1.08 (m,2H) ; 1.10-1.17 (m,2H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.52-3.59 (m,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.30-4.41 (m,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 6.93 (s br,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.46 (s,1H). |
| 1.11-211 | [CDCl ₃] 2.24 (s,3H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.81 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 4.26-4.38 (m,2H) ; 6.82 (s br,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.28 (s,1H). |
| 1.11-212 | [CDCl ₃] 1.45 (t,3H) ; 2.24 (s,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.08 (q,2H) ; 4.27-4.39 (m,2H) ; 6.80 (s br,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.21 (d,2H) ; 7.33 (s,1H). |
| 1.11-213 | [CDCl ₃] 1.47 (t,3H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 4.08 (q, 2H) ; 4.33 (d,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.03 (s br,1H) ; 7.20 (d,1H) ; 7.72 (s,1H). |
| 1.11-238 | [CDCl ₃] 3.34 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.80 (d,1H) ; 4.60 (d,2H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.26 (d,1H) ; 7.33 (t br,1H) ; 7.76 (d,1H) ; 8.35 (d,1H). |
| 1.11-239 | [CDCl ₃] 3.37 (d,1H) ; 3.40 (s,3H) ; 3.95 (d,1H) ; 4.62 (d,2H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.28 (s, 1H) ; 7.30 (d,1H) ; 8.48 (d,1H) ; 8.58 (s,1H). |
| 1.11-240 | [CDCl ₃] 2.22 (s,3H) ; 2.36 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.44 (s,3H) ; 6.93 (t,1H) ; 7.21 (d,2H), 7.76 (s br,1H). |
| 1.11-241 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.97(d,1H) ; 4.56-4.69 (m,2H) ; 6.91(t,1H) ; 6.93 (m,1H) ; 7.21 (d,2H) ; 7.28 (s br,1H) ; 8.19 (s,1H). |
| 1.11-242 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.95 (d,1H) ; 4.52-4.66 (m,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.23 (s br,1H) ; 7.32 (s,1H) ; 8.36 (s,1H). |
| 1.11-243 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.40 (s,3H) ; 3.96 (d,1H) ; 4.51- 4.64 (m,2H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.22 (d,2H), 7.31 (s,1H) ; 8.49 (s,1H). |
| 1.11-244 | [CDCl ₃] 3.35 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.91 (s,3H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.45-4.60 (m,2H) ; 6.73 (s,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.20 (s br,1H) ; 7.21 (d,2H) ; 8.23 (s,1H). |

| 編號 | NMR |
|----------|--|
| 1.11-245 | [CDCl ₃] 2.29 (s,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.40 (s,3H) ; 3.97 (d,1H) ; 4.42-4.57 (m,2H) ; 6.92 (t,1H) ; 7.10 (s br,1H) ; 7.18 (s,1H) ; 7.21 (d,2H) ; 8.18 (s,1H). |
| 1.11-246 | [CDCl ₃] 2.55 (s,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.94 (d,1H) ; 4.50 (d,2H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.03 (t br,1H) ; 7.16 (d,1H) ; 7.20 (d, 2H) ; 7.53 (d,1H). |
| 1.11-247 | [CDCl ₃] 2.58 (s,3H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.94 (d,1H) ; 4.48-4.60 (m,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.02 (t br,1H) ; 7.15 (dd,1H) ; 7.21 (d,1H) ; 7.56 (d,1H) ; 8.45 (d,1H). |
| 1.11-248 | [CDCl ₃] 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.90 (d,1H) ; 4.43-4.55 (m,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.19 (s br,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.48 (d,1H) ; 7.54 (d,1H) ; 8.33 (s,1H). |
| 1.11-249 | [CDCl ₃] 2.21 (s,3H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.91 (s,3H) ; 3.94 (d,1H) ; 4.47 (qd,2H) ; 6.62 (s,1H) ; 6.91 (t,1H) ; 7.03 (t br,1H) ; 7.21 (d,2H) ; 7.94 (s,1H). |
| 1.11-250 | [CDCl ₃] 2.28 (s,3H) ; 2.53 (s,3H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.96 (d,1H) ; 4.43-4.54 (m,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.02 (s br,1H), 7.02 (s,1H) ; 7.21 (d,2H) ; 8.30 (s,1H). |
| 1.11-251 | [CDCl ₃] 2.56 (s,3H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.88 (d,1H) ; 4.44-4.57 (m,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.08 (s br,1H) ; 7.15 (d,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.56 (d,1H) ; 8.45 (s,1H). |
| 1.11-252 | [CDCl ₃] 3.34 (d,1H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.80 (d,1H) ; 3.91 (s,3H) ; 3.98 (s,3H) ; 4.32-4.47 (m,2H) ; 6.27 (d,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.17 (s br,1H) ; 7.19 (d,2H) ; 7.49 (d,1H). |
| 1.11-253 | [CDCl ₃] 2.32 (s,3H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.91 (d,1H) ; 4.36 (d,2H) ; 6.91 (t,1H) ; 6.95 (t br,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 8.34 (s,1H). |
| 1.11-254 | [CDCl ₃] 3,34 (s,3H) ; 3,35 (s,3H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.74 (t,2H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.26 (t,2H) ; 4.32-4.46 (m,2H) ; 6.91 (t,1H) ; 6.93 (s br,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.47 (s,2H). |
| 1.11-255 | [CDCl ₃] 1.47 (t,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 4.11 (q, 2H) ; 4.32 (d,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.03 (t br,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.40 (s,1H). |
| 1.11-256 | [CDCl ₃] 1.44 (t,3H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.83 (d,1H) ; 4.00 (q,2H) ; 4.30 (d,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.03 (t br,1H) ; 7.19 (d,2H) ; 7.32 (s,1H). |
| 1.11-257 | [CDCl ₃] 1.42 (t,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.80 (d,1H) ; 3.91 (s,3H) ; 3.96 (q,2H) ; 4.21-4.32 (m,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.02 (s br,1H) ; 7.19 (d,2H) ; 7.20 (s,1H). |
| 1.11-258 | [CDCl ₃] 3.33 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.78 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 3.90 (s,3H) ; 4.20-4.30 (m,2H) ; 6.89 (t,1H) ; 7.02 (s br,1H) ; 7.16 (s,1H) ; 7.19 (d,2H) ; |
| 1.11-259 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 2.58 (q,2H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.74 (s,3H) ; 3.83 (d,1H) ; 4.40-4.52 (m,2H) ; 5.98 (s,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.18 (s br,1H) ; 7.20 (d,2H). |

分析數據表 1.14

| 編號 | NMR |
|--------|---|
| 1.14-1 | [CDCl ₃] 2.39 (s,3H) ; 3.40 (s,3H) ; 3.43 (d,1H) ; 3.85 (d,1H) ; 5.90 (s br,1H) ; 6.72 (s br,1H) ; 6.98 (d,1H) ; 7.20 (d,1H) ; 7.24 (s,1H). |
| 1.14-9 | 2.39 (s,3H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 3.85-3.96 (m,1H) ; 4.03-4.17 (m,1H) ; 6.98 (d,1H) ; 7.08 (t br,1H) ; 7.20 (d,1H) ; 7.25 (s,1H). |

| 編號 | NMR |
|----------|--|
| 1.14-16 | [CDCl ₃] 2.38 (s,3H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 3.90-4.05 (m,2H) ; 5.19 (d,1H) ; 5.24 (d,1H) ; 5.81-5.92 (m,1H) ; 6.86 (s br,1H) ; 6.97 (d,1H) ; 7.20 (d,1H) ; 7.24 (s,1H). |
| 1.14-60 | [CDCl ₃] 0.60 (m,2H) ; 0.84 (m,2H) ; 2.38 (s,3H) ; 2.82 (s,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.84 (d,1H) ; 6.83 (s br,1H) ; 6.97 (d,1H) ; 7.19 (d,1H) ; 7.23 (s,1H). |
| 1.14-94 | [CDCl ₃] 1.27 (t,3H) ; 2.38 (s,3H) ; 2.59 (m,2H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.57-3.66 (m,2H) ; 3.84 (d,1H) ; 4.17 (q,2H) ; 6.97 (d,1H) ; 7.19 (d,1H) ; 7.24 (s,1H) ; 7.32 (s br,1H). |
| 1.14-96 | [CDCl ₃] 1.12-1.34 (m,6H) ; 2.38 (s,3H) ; 2.51-2.62 (m,2H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.83 (d,1H) ; 4.10-4.22 (m,2H) ; 4.36-4.44 (m,1H) ; 6.96 (d,1H) ; 7.20 (d,1H) ; 7.24 (s,1H) ; 7.26 (s br,1H). |
| 1.14-102 | [CDCl ₃] 1.91 (quin,2H) ; 2.38 (m,5H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.38 (d,1H) ; 3.33-3.45 (m,2H) ; 3.69 (s,3H) ; 3.85 (d,1H) ; 6.92 (t br,1H) ; 6.97 (d,1H) ; 7.20 (d,1H) ; 7.25 (s,1H). |
| 1.14-110 | [CDCl ₃] 2.39 (s,3H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.38 (d,1H) ; 4.49-4.56 (m,2H) ; 6.98 (d,1H) ; 7.20 (d,1H) ; 7.21 (s br,1H) ; 7.24 (s,1H) ; 7.32 (d,1H) ; 7.65 (d,1H) ; 8.35 (s,1H). |
| 1.14-136 | [CDCl ₃] 2.39 (s,3H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.97 (d,1H) ; 4.48-4.59 (m,2H) ; 6.98 (d,1H) ; 7.16 (d,1H) ; 7.21 (d,1H) ; 7.25 (s,2H) ; 7.26 (s br,1H) ; 8.36 (d,1H). |
| 1.14-206 | [CDCl ₃] 1.48 (t,3H) ; 2.38 (s,3H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.14 (q,2H) ; 4.31-4.43 (m,2H) ; 6.94 (s br,1H) ; 6.97 (d,1H) ; 7.18 (d,1H) ; 7.24 (s,1H) ; 7.40 (s,1H) ; 7.45 (s,1H). |
| 1.14-212 | [CDCl ₃] 1.43 (t,3H) ; 2.25 (s,3H) ; 2.38 (s,3H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.10 (q,2H) ; 4.29-4.38 (m,2H) ; 6.83 (s br,1H) ; 6.97 (d,1H) ; 7.19 (d,1H) ; 7.24 (s,1H) ; 7.41 (s,1H). |

分析數據表 1.16

| 編號 | NMR |
|----------|---|
| 1.16-1 | [CDCl ₃] 3.39 (d,1H) ; 3.41 (s,3H) ; 3.83 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 5.68 (s br,1H) ; 6.70 (s br,1H) ; 6.71 (d,1H) ; 6.96 (d,1H) ; 7.01 (s,1H). |
| 1.16-60 | [CDCl ₃] 0.60 (m,2H) ; 0.84 (m,2H) ; 2.81-2.84 (m,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.83 (s,3H) ; 3.85 (d,1H) ; 6.69 (d,1H) ; 6.82 (s br,1H) ; 6.94 (d,1H) ; 7.00 (s,1H). |
| 1.16-94 | [CDCl ₃] 1.28 (t,3H) ; 2.59 (m,2H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.58-3.67 (m,2H) ; 3.83 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 4.17 (q,2H) ; 6.70 (d,1H) ; 6.97 (d,1H) ; 7.01 (s,1H) ; 7.31 (t br,1H). |
| 1.16-96 | [CDCl ₃] 1.24-1.32 (m,6H) ; 2.52-2.62 (m,2H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.82 (d,1H) ; 3.84 (s,3H) ; 4.11-4.21 (m,2H) ; 4.36-4.43 (m,1H) ; 6.69 (d,1H) ; 6.95 (d,1H) ; 7.01 (s,1H). |
| 1.16-110 | [CDCl ₃] 3.35 (s,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.83 (s,3H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.47-4.56 (m,2H) ; 6.70 (d,1H) ; 6.95 (d,1H) ; 7.01 (s,1H) ; 7.21 (t br,1H) ; 7.32 (d,1H) ; 7.65 (d,1H) ; 8.35 (s,1H). |
| 1.16-136 | [CDCl ₃] 3.39 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.84 (s,3H) ; 3.96 (d,1H) ; 4.48-4.59 (m,2H) ; 6.71 (d,1H) ; 6.97 (d,1H) ; 7.02 (s,1H) ; 7.16 (d,1H) ; 7.27 (s br,2H) ; 8.36 (d,1H). |

| 編號 | NMR |
|----------|---|
| 1.16-212 | [CDCl ₃] 1.45 (t,3H) ; 2.26 (s,3H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.84 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.10 (q,2H) ; 4.30-4.36 (m,2H) ; 6.71 (d,1H) ; 6.82 (t br,1H) ; 6.94 (d,1H) ; 7.00 (s,1H) ; 7.32 (s,1H). |

分析數據表 1.18

| 編號 | NMR |
|----------|--|
| 1.18-1 | [CDCl ₃] 3.42 (s,3H) ; 3.43 (d,1H) ; 3.92 (d,1H) ; 5.86 (s br,1H) ; 6.70 (s br,1H) ; 7.43 (d,1H) ; 7.61 (d,1H) ; 7.70 (s,1H). |
| 1.18-9 | [CDCl ₃] 3.40 (s,3H) ; 3.43 (d,1H) ; 3.83-3.98 (m,1H) ; 3.82 (d,1H) ; 4.03-4.19 (m,1H) ; 7.08 (s br,1H) ; 7.43 (d,1H) ; 7.60 (d,1H) ; 7.69 (s,1H). |
| 1.18-16 | [CDCl ₃] 3.39 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.93 (d,1H) ; 3.92-4.06 (m,2H) ; 5.19 (d,1H) ; 5.25 (d,1H) ; 5.82-5.93 (m,1H) ; 6.87 (s br,1H) ; 7.42 (d,1H) ; 7.60 (d,1H) ; 7.70 (s,1H). |
| 1.18-60 | [CDCl ₃] 0.60 (m,2H) ; 0.85 (m,2H) ; 2.80-2.84 (m,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.38 (d,1H) ; 3.92 (d,1H) ; 6.82 (s br,1H) ; 7.41 (d,1H) ; 7.59 (d,1H) ; 7.69 (s,1H). |
| 1.18-94 | [CDCl ₃] 1.28 (t,3H) ; 2.60 (m,2H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.63 (q,2H) ; 3.90 (d,1H) ; 4.18 (q,2H) ; 7.30 (t br,1H) ; 7.42 (d,1H) ; 7.60 (d,1H) ; 7.69 (s,1H). |
| 1.18-96 | [CDCl ₃] 1.25-1.32 (m,6H) ; 2.50-2.51 (m,2H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.13-4.21 (m,2H) ; 4.31-4.46 (m,1H) ; 7.27 (s br,1H) ; 7.41 (d,1H) ; 7.60 (d,1H) ; 7.70 (s,1H). |
| 1.18-102 | [CDCl ₃] 1.92 (quin, 2H) ; 2.41 (t,2H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.36-3.43 (m,3H) ; 3.91 (d,1H) ; 6.96 (s br,1H) ; 7.41 (d,1H) ; 7.60 (d,1H) ; 7.70 (s,1H). |
| 1.18-110 | [CDCl ₃] 3.37 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.98 (d,1H) ; 4.48-4.56 (m,2H) ; 7.21 (t br,1H) ; 7.33 (d,1H) ; 7.42 (d,1H) ; 7.60 (d,1H) ; 7.65 (d,1H) ; 7.69 (s,1H) ; 8.35 (s,1H). |
| 1.18-136 | [CDCl ₃] 3.41 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 4.04 (d,1H) ; 4.49-4.59 (m,2H) ; 7.16 (d,1H) ; 7.43 (d,1H) ; 7.62 (d,1H) ; 7.71 (s,1H) ; 8.36 (d,1H). |
| 1.18-206 | [CDCl ₃] 1.48 (t,3H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.38 (d,1H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.15 (q,2H) ; 4.31-4.43 (m,2H) ; 6.95 (s br,1H) ; 7.40 (s,1H) ; 7.41 (d,1H) ; 7.46 (s,1H) ; 7.58 (d,1H) ; 7.69 (s,1H). |
| 1.18-212 | [CDCl ₃] 1.46 (t,3H) ; 2.25 (s,3H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.38 (d,1H) ; 3.93 (d,1H) ; 4.10 (q,2H) ; 4.28-4.39 (m,2H) ; 6.81 (s br,1H) ; 7.32 (s,1H) ; 7.42 (d,1H) ; 7.60 (d,1H) ; 7.69 (s,1H). |

分析數據表 1.20

| 編號 | NMR |
|--------|--|
| 1.20-1 | [CDCl ₃] 3.38 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 5.85 (s br,1H) ; 6.70 (s br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| 1.20-4 | [CDCl ₃] 0.96 (t,3H) ; 1.59 (m,2H) ; 3.27-3.33 (m,3H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.85 (d,1H) ; 6.78 (s,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |

| 編號 | NMR |
|---------------|---|
| 1.20-5 | [CDCl ₃] 1.21 (d,3H) ; 1.23 (d,3H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 4.04-4.18 (m,1H) ; 6.58 (d br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-7 | [CDCl ₃] D1 : 0.93 (t,3H) ; 1.18 (d,3H) ; 1.48 -1.58 (m,2H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.83 (d,1H) ; 3.90-4.02 (m,1H) ; 6.55 (d br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). D2 : 0.96 (t,3H) ; 1.20 (d,3H) ; 1.48 -1.58 (m,2H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 3.90-4.02 (m,1H) ; 6.55 (d br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-8 | [CDCl ₃] D1 : 0.93 (d,6H) ; 1.13 (d,3H) ; 1.69-1.81 (m,1H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.82 (d,1H) ; 3.83-3.96 (m,1H) ; 6.58 (d br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). D2 : 0.95 (d,6H) ; 1.15 (d,3H) ; 1.69-1.81 (m,1H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.85 (d,1H) ; 3.83-3.96 (m,1H) ; 6.58 (d br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-9 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 3.84-3.97 (m,1H) ; 4.02-4.17 (m,1H) ; 7.05 (s br,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-10 | [CDCl ₃] 3.33 (d,1H), 3.38 (s,3H) ; 3.66-3.80 (m,2H) ; 3.89 (d,1H) ; 5.78-6.05 (tt,1H) ; 7.02 (s,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| 1.20-11 | [CDCl ₃] 3.38 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.84 (d,1H) ; 3.91-4.01 (m,1H) ; 4.08-4.20 (m,1H) ; 7.03 (s,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| 1.20-15 | [CDCl ₃] 2.67-2.73 (m,2H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.59-3.68 (m,2H) ; 3.89 (d,1H) ; 7.20 (s,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-16 | [CDCl ₃] 3.34 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 3.90-4.06 (m,2H) ; 5.20 (d,1H) ; 5.25 (d,1H) ; 5.80-5.93 (m,1H) ; 6.85 (s br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-19 D1 | [CDCl ₃] D1 : 1.26 (d,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.37-3.45 (m,2H) ; 3.83 (d,1H) ; 4.13-4.26 (m,1H) ; 6.93 (d br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-19 D2 | [CDCl ₃] D2 : 1.23 (d,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.40 (s,3H) ; 3.37-3.45 (m,2H) ; 3.83 (d,1H) ; 4.14-4.27 (m,1H) ; 6.91 (d br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-20 | [CDCl ₃] 1.43 (t,3H) ; 2.57-2.66 (m,1H) ; 2.75-2.89 (m,1H) ; 3.31 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.84-3.91 (m,1H) ; 4.29 (m,1H) ; 6.83 (s,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-21 | [CDCl ₃] 1.11-1.20 (m,6H) ; 3.30-3.42 (m,8H) ; 3.77-3.85 (m,1H) ; 4.02 (m,1H) ; 7.02 (m,1H) ; 7.42 (m,1H) ; 7.55 (m,2H). |
| 1.20-24 | [CDCl ₃] 3.00 (s,3H) ; 3.29-3.36 (m,3H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.86-3.93 (m,3H) ; 7.43 (m,2H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-25 | [CDCl ₃] 1.28 (t,3H) ; 2.58 (q,2H) ; 2.73 (t,2H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.48-3.61 (m,2H) ; 3.85 (d,1H) ; 7.12 (s br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-40 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.17-4.89(m,2H) ; 7.18 (t br,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-41 D1 | [CDCl ₃] D1 : 1.65 (d,3H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.90-4.99 (m,1H) ; 7.05 (s br,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-41 D2 | [CDCl ₃] D2 : 1.64 (d,3H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.95 (d,1H) ; 4.89-4.98 (m,1H) ; 7.05 (s br,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-42 | [CDCl ₃] 1.78 (s,6H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.99 (d,1H) ; 6.80 (s,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |

| 編號 | NMR |
|---------------|--|
| 1.20-45 | [CDCl ₃] 1.09-1.18 (m,3H) ; 1.73 (d, 3H) ; 1.98-2.13 (m,2H) ; 3.30 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.92-4.00 (m,1H) ; 6.79 (d,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| 1.20-46 D1 | [CDCl ₃] D1 1.04 (t,3H) ; 1.59 (m,2H) ; 1.75 (s,3H) ; 1.89 (m,1H) ; 2.00 (m,1H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.98 (d,1H) ; 6.80 (s,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| 1.20-46 D2 | [CDCl ₃] D2 1.01 (t,3H) ; 1.52 (m,2H) ; 1.74 (s,3H) ; 1.92 (m,1H) ; 2.05 (m,1H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.97 (d,1H) ; 6.78 (s,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| 1.20-47 | [CDCl ₃] 0.70-0.80 (m,4H) ; 1.26-1.33 (m,1H) ; 1.82 (d,3H) ; 3.30-3.34 (m,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.90-4.02 (m,1H) ; 7.00 (m,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| 1.20-48 D1 | [CDCl ₃] D1 1.40 (d,3H) ; 3.38 (s,3H), 3.39 (d,1H), 3.88 (d,1H) ; 4.73 (m,1H) ; 6.85 (d,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| 1.20-48 D2 | [CDCl ₃] D2 1.40 (d,3H) ; 3.38 (s,3H), 3.39 (d,1H), 3.80 (d,1H) ; 4.72 (m,1H) ; 6.80 (d,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| 1.20-49 D1 | [CDCl ₃] D1 1.03 (t,3H) ; 1.58-1.64 (m,1H) ; 1.90-2.00 (m,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.80 (d,1H) ; 4.55 (m,1H) ; 6.70 (d,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-49 D2 | [CDCl ₃] D2 1.02 (t,3H) ; 1.58-1.64 (m,1H) ; 1.90-2.00 (m,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.90 (d,1H) ; 4.55 (m,1H) ; 6.75 (d,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| 1.20-50 | [CDCl ₃] D1 : 0.98-1.07 (m,6H) ; 2.16-2.28 (m,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.78 (d,1H) ; 3.46-4.58 (m,1H) ; 6.84 (d br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). D2 : 0.98-1.07 (m,6H) ; 2.16-2.28 (m,1H) ; 3.40 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.90 (d,1H) ; 3.46-4.58 (m,1H) ; 6.88 (d br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| 1.20-51 D1 | [CDCl ₃] D1 1.80 (m,1H) ; 1.95 (m,2H) ; 2.09 (m,1H) ; 3.38 (s,3H), 3.39 (d,1H) ; 3.80-3.91 (m,3H) ; 4.18 (q,1H), 4.72 (m,1H) ; 7.00 (m,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| 1.20-51 D2 | [CDCl ₃] D2 1.60 (m,1H) ; 1.93 (m,2H) ; 2.14 (m,1H) ; 3.38 (s,3H), 3.42 (d,1H) ; 3.80 (d,1H) ; 3.83-3.97 (m,2H) ; 4.30 (m,1H), 4.65 (m,1H) ; 7.20 (d,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| 1.20-51 D3 | [CDCl ₃] D3 1.62 (m,1H) ; 1.91 (m,2H) ; 2.10 (m,1H) ; 3.37 (s,3H), 3.38 (d,1H) ; 3.84-3.97 (m,3H) ; 4.30 (m,1H), 4.64 (m,1H) ; 7.21 (s,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| 1.20-51 D4 | [CDCl ₃] D4 1.80 (m,1H) ; 1.93 (m,2H) ; 2.08 (m,1H) ; 3.38 (s,3H), 3.39 (d,1H) ; 3.81-3.91 (m,2H) ; 4.18 (q,1H), 4.73 (m,1H) ; 7.00 (m,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H) |
| 1.20-53 | [CDCl ₃] 1.49 (t,3H) ; 2.30 (m,1H) ; 3.33 (m,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.80-3.90 (m,1H) ; 4.83 (m,1H) ; 6.93 (s,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-55 | [CDCl ₃] D1 : 1.42 (d,3H) ; 1.81 (s,3H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.80 (d,1H) ; 4.71-4.81 (m,1H) ; 6.88 (d br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). D2 : 1.45 (d,3H) ; 1.82 (s,3H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.71-4.81 (m,1H) ; 6.88 (d br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-58 | [CDCl ₃] D1 : 1.18 (d,3H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.43 (s,3H) ; 3.46 (s,3H) ; 3.81 (d,1H) ; 4.16-4.28 (m,2H) ; 6.87 (t br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). D2 : 1.20 (d,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.43 (s,3H) ; 3.44 (s,3H) ; 3.82 (d,1H) ; 4.16-4.28 (m,2H) ; 6.87 (t br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |

| 編號 | NMR |
|---------------|--|
| 1.20-59 | [CDCl ₃] 1.11 (m,3H) ; 1.42 (m,3H) ; 2.48-2.63 (m,2H) ; 3.32 (m,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.79-3.88 (m,1H) ; 4.62 (m,1H) ; 7.43-7.50 (m,2H) ; 7.55 (m,2H). |
| 1.20-60 | [CDCl ₃] 0.59 (m,2H) ; 0.84 (m,2H) ; 2.82 (m,1H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.88 (d,1H) ; 6.79 (s,1H) ; 7.43 (m,1H) ; 7.54 (m,2H). |
| 1.20-60 E1 | [CDCl ₃] 0,56-0.62 (m,2H) ; 0.82-0.89 (m,2H) ; 2.77-2.86 (m-1H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 6.78 (s br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.54 (s,2H). |
| 1.20-60 E2 | [CDCl ₃] 0,56-0.62 (m,2H) ; 0.82-0.89 (m,2H) ; 2.77-2.86 (m-1H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 6.78 (s br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.54 (s,2H). |
| 1.20-62 | [CDCl ₃] D1 : 0.27-0.32 (m,2H) ; 0.43-0.53 (m,2H) ; 0.82-0.93 (m,1H) ; 1.26 (d,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.37-3.46 (m,1H) ; 3.82 (d,1H) ; 6.76 (s br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). D2 : 0.33-0.43 (m,2H) ; 0.53-0.62 (m,2H) ; 0.82-0.93 (m,1H) ; 1.28 (d,3H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.41 (s,3H) ; 3.37-3.46 (m,1H) ; 3.83 (d,1H) ; 6.76 (s br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| 1.20-64 | [CDCl ₃] 1.26-1.38 (m,2H) ; 1.58-1.68 (m,2H) ; 3.30 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.96 (d,1H) ; 7.23 (s,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-69 | [CDCl ₃] 3.30 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.39(dd,4H) ; 3.87(d,1H) ; 5.22-5.33 (m,1H) ; 7.18 (d br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.55 (s,1H). |
| 1.20-70 | [CDCl ₃] D1 3.20-3.30 (m,2H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.49-3.58 (m,1H) ; 3.67-3.74 (m,1H) ; 3.90 (d,1H) ; 4.10-4.18 (m,2H) ; 4.41-4.53 (m,1H) ; 7.19 (s br,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). D2 3.20-3.30 (m,2H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.49-3.58 (m,1H) ; 3.67-3.74 (m,1H) ; 3.91 (d,1H) ; 4.10-4.18 (m,2H) ; 5.14-5.23 (m,1H) ; 7.12 (s br,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-71 | [CDCl ₃] 3.31 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.93 (d,1H) ; 4.00-4.11 (m,2H) ; 4.52-4.63 (m,2H) ; 4.71-4.79 (m,1H) ; 7.35 (d br,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-73 | [CDCl ₃] 1.83 -1.92 (m,1H) ; 2.26-2.38 (m,1H) ; 3.32 (dd,1H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.70-3.76 (m,1H) ; 3.78-3.91(m,3H) ; 3.93-4.03(m,1H) ; 4.51-4.61 (m,1H) ; 6.93 (s br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-74 | [CDCl ₃] 1.59-1.68 (m,1H) ; 2.02-2.14 (m,1H) ; 2.47-2.59 (m,1H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.33-3.45 (m,2H) ; 3.56 (dd,1H) ; 3.72-3.79 (m,1H) ; 3.81-3.94 (m,2H) ; 3.87 (d,1H) ; 6.91 (t br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-76 | [CDCl ₃] D1 : 0.92 (t,3H) ; 1.18 (d,3H) ; 1.32-1.43 (m,2H) ; 1.43-1.52 (m,2H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.40 (s,3H) ; 3.82 (d,1H) ; 3.97-4.09 (m,1H) ; 6.53 (d br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). D2 : 0.94 (t,3H) ; 1.20 (d,3H) ; 1.32-1.43 (m,2H) ; 1.43-1.52 (m,2H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.40 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 3.97-4.09 (m,1H) ; 6.53 (d br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-93 | [CDCl ₃] 2.63 (t,2H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.62 (q,2H) ; 3.73 (s,3H) ; 3.85(d,1H) ; 7.27 (t br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.56 (2H). |
| 1.20-96 | [CDCl ₃] 1.28 (m,6H) ; 2.56 (m,2H) ; 3.34 (d,1H), 3.36 (s,3H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.16 (m,2H) ; 4.39 (m,1H) ; 7.24 (s,1H) ; 7.42 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-102 | [CDCl ₃] 1.91 (quint,2H) ; 2.40 (t,2H) ; 3.30 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.39 (m,2H) ; 3.69 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 6.90 (s,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-110 | [CDCl ₃] 3.35 (s,3H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.52 (m,2H) ; 7.20 (s,1H) ; 7.32 (d,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.55 (s,2H) ; 7.65 (d,1H) ; 8.35 (s,1H). |

| 編號 | NMR |
|----------|---|
| 1.20-119 | [CDCl ₃] 3.35 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.94 (d,1H) ; 4.56-4.68 (m,2H) ; 7.25 (s br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.55 (s,2H) ; 7.68 (d,1H) ; 7.85 (d,1H) ; 8.68 (s,1H). |
| 1.20-135 | [CDCl ₃] 3.34 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.96 (d,1H) ; 4.55 (d,2H) ; 7.21 (d,3H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.56 (s,2H) ; 8.59 (d,2H). |
| 1.20-136 | [CDCl ₃] 3.86 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.95 (d,1H) ; 4.45-4.60 (m,2H) ; 7.16 (d,1H) ; 7.23 (s br,1H) ; 7.24 (s,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.56 (s,2H) ; 8.36 (d,1H). |
| 1.20-137 | [CDCl ₃] 3.34 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.96 (d,1H) ; 4.57 (m,2H) ; 6.86 (m,1H) ; 7.11 (m,1H) ; 7.20 (s,1H) ; 7.47 (s,1H) ; 7.57 (s,2H) ; 8.20 (d,1H). |
| 1.20-138 | [CDCl ₃] 3.37 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.97 (d,1H) ; 4.45-4.58 (m,2H) ; 7.18 (d,1H) ; 7.23 (t br,1H) ; 7.41 (s,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.57 (s,2H) ; 8.34 (d,1H). |
| 1.20-142 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.92 (d,1H) ; 3.93 (s,3H) ; 4.41-4.56 (m,2H) ; 6.65 (s,1H) ; 6.79 (d,1H) ; 7.13 (t br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.56 (s,2H) ; 8.13 (d,1H). |
| 1.20-147 | [CDCl ₃] 2.56 (s,3H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.95 (d,1H) ; 4.44-4.56 (m,2H) ; 7.02 (d,1H) ; 7.08 (s,1H) ; 7.14 (t br,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H) ; 8.47 (d,1H). |
| 1.20-148 | [CDCl ₃] 1.31 (t,3H) ; 2.81 (q,2H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.95 (d,1H) ; 4.45-4.58 (m,2H) ; 7.03 (d,1H) ; 7.08 (s,1H) ; 7.15 (t br,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H) ; 8.50 (d,1H). |
| 1.20-149 | [CDCl ₃] 0.94-1.06 (m,4H) ; 1.97-2.06 (m,1H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.95 (d,1H) ; 4.42-4.56 (m,2H) ; 6.95 (d,1H) ; 7.05 (s,1H) ; 7.13 (t br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.56 (s,2H) ; 8.40 (d,1H). |
| 1.20-150 | [CDCl ₃] 0.97 (t,3H) ; 1.70-1.82 (m,2H) ; 2.73-2.83 (m,2H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.94 (d,1H) ; 4.43-4.58 (m,2H) ; 7.04 (d,1H) ; 7.07 (s,1H) ; 7.15 (s br,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H) ; 8.50 (d,1H). |
| 1.20-152 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.97 (d,1H) ; 4.55-4.69 (m,2H) ; 7.28 (t br,1H) ; 7.42 (d,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H) ; 7.61 (s,1H) ; 8.71 (d,1H). |
| 1.20-191 | [CDCl ₃] 3.39 (d,1H) ; 3.43 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 3.95 (s,6H) ; 4.50-4.64 (m,2H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.56 (s,2H) ; 7.45 (s br,1H). |
| 1.20-199 | [CDCl ₃] 3.33 (d,1H), 3.34 (s,3H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.33-4.47 (m,2H) ; 7.08 (t br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.56 (s,2H) ; 8.31 (s,1H) ; 8.45 (s,1H). |
| 1.20-200 | [CDCl ₃] 2.46 (s,3H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.33 (s,3H) ; 3.88 (d,1H) ; 4.23-4.37 (m,2H) ; 7.00 (s br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.56 (s,2H) ; 8.19 (s,1H). |
| 1.20-201 | [CDCl ₃] 2.26 (s,3H) ; 2.42 (s,3H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.33 (s,3H) ; 3.91 (d,1H) ; 4.22-4.33 (m,2H) ; 6.80 (t br,1H) ; 7.46 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-202 | [CDCl ₃] 1.30 (t,3H) ; 2.42 (s,3H) ; 2.65 (q,2H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.90 (d,1H) ; 4.21-4.34 (m,2H) ; 6.75 (s br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-203 | [CDCl ₃] 1.29 (t,3H) ; 1.30 (t,3H) ; 2.66 (q,2H) ; 2.78 (q,2H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.33 (s,3H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.24-4.33 (m,2H) ; 7.75 (s br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-206 | [CDCl ₃] 1.49 (t,3H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.88 (d,1H) ; 4.14 (m,2H) ; 4.38 (m,2H) ; 6.90 (s,1H) ; 7.40 (s,1H) ; 7.43 (m,2H) ; 7.54 (s,2H). |
| 1.20-207 | 3.33 (d,1H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.88 (d,1H) ; 4.33-4.46 (m,2H) ; 4.68 (q,2H) ; 7.01 (s br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.53 (s,1H) ; 7.55 (s,2H) ; 7.56 (s,1H). |

| 編號 | NMR |
|----------|--|
| 1.20-208 | [CDCl ₃] 3.34 (s,3H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.38-4.48 (m,4H) ; 5.93-6.21 (tt,1H) ; 6.98 (s,1H) ; 7.42 (m,1H) ; 7.49 (s,1H) ; 7.54 (m,3H). |
| 1.20-210 | [CDCl ₃] 0.98-1.08 (m,2H) ; 1.09-1.14 (m,2H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.53-3.60 (m,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.30-4.42 (m,2H) ; 6.92 (s br,1H) ; 7.44 (s,2H) ; 7.46 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 1.20-211 | [CDCl ₃] 2.24 (s,3H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.81 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 4.26-4.38 (m,2H) ; 6.82 (s br, 1H) ; 7.28 (s,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.54 (s,2H). |
| 1.20-212 | [CDCl ₃] 1.46 (t,3H) ; 2.25 (s,3H) ; 3.33 (s,3H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.08 (q,2H) ; 4.33 (m,2H) ; 6.80 (s,1H) ; 7.31 (s,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.54 (s,2H). |
| 1.20-213 | [CDCl ₃] 1.47 (t,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 4.08 (q, 2H) ; 4.33 (d,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.03 (s br,1H) ; 7.21 (d,2H) ; 7.42 (s,1H). |
| 1.20-241 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.97 (d,1H) ; 4.54-4.68 (m,2H) ; 6.94 (d,1H) ; 7.27 (s br,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.57 (s,2H) ; 8.19 (s,1H). |
| 1.20-242 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.96 (d,1H) ; 4.51-4.64 (m,2H) ; 7.23 (s br,1H) ; 7.31 (s,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.57 (s,2H) ; 8.36 (s,1H). |
| 1.20-243 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.96 (d,1H) ; 4.51-4.63 (m,2H) ; 7.25 (s br,1H) ; 7.30 (s,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.57 (s,2H) ; 8.46 (s,1H). |
| 1.20-244 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.91 (s,3H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.45-4.59 (m,2H) ; 6.73 (s,1H) ; 7.21 (t br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.56 (s,2H) ; 8.23 (s,1H). |
| 1.20-255 | [CDCl ₃] 1.47 (t,3H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.11 (q, 2H) ; 4.32 (d,2H) ; 7.03 (s br,1H) ; 7.40 (s,1H) ; 7.43 (s,1H), 7.55 (s,2H). |
| 1.20-257 | [CDCl ₃] 1.42 (t,3H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.81 (d,1H) ; 3.91 (s,3H) ; 3.96 (q,2H) ; 4.21-4.32 (m,2H) ; 7.00 (s br,1H) ; 7.20 (s,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.54 (s,2H). |

分析數據表 1.25

| 編號 | NMR |
|---------|--|
| 1.25-1 | [CDCl ₃] 3.37 (d,1H) ; 3.41 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 5.60 (s br,1H) ; 6.76 (s br,1H) ; 7.32 (s,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.58 (s,1H). |
| 1.25-9 | [CDCl ₃] 3.39 (s,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.33-3.46 (m,1H) ; 4.02-4.18 (m,1H) ; 7.05 (t br,1H) ; 7.32 (s,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.58 (s,1H). |
| 1.25-16 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.89 (d,1H) ; 3.90-4.06 (m,2H) ; 5.20 (d,1H) ; 5.25 (d,1H) ; 5.81-5.92 (m,1H) ; 6.84 (s br,1H) ; 7.31 (s,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.58 (s,1H). |
| 1.25-60 | [CDCl ₃] 0.57-0.61 (m,2H) ; 0.81-0.87 (m,2H) ; 2.78-2.86 (m,1H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 6.78 (s br,1H) ; 7.31 (s,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.57 (s,1H). |
| 1.25-94 | [CDCl ₃] 1.28 (t,3H) ; 2.59 (t,2H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.62 (q,2H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.18 (q,1H) ; 7.28 (s br,1H) ; 7.31 (s,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.58 (s,1H). |
| 1.25-96 | [CDCl ₃] 1.23-1.32 (m,6H) ; 2.50-2.62 (m,2H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.11-4.21 (m,2H) ; 4.33-4.45 (m,1H) ; 7.25 (s br,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.52 (s,1H) ; 7.58 (s,1H). |

| 編號 | NMR |
|----------|---|
| 1.25-102 | [CDCl ₃] 1.92 (quin, 2H) ; 2.40 (t,2H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.36-3.43 (m,2H) ; 3.69 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 6.92 (s br,1H) ; 7.31 (s,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.58 (s,1H). |
| 1.25-110 | [CDCl ₃] 3.35 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.45-4.57 (m,2H) ; 7.15 (t br,1H) ; 7.32 (d,1H) ; 7.34 (s,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.58 (s,1H) ; 6.64 (d,1H) ; 8.35 (s,1H). |
| 1.25-136 | [CDCl ₃] 3.37 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.98 (d,1H) ; 4.46-4.60 (m,2H) ; 7.17 (d,1H) ; 7.33 (s,1H) ; 7.46 (s,1H) ; 7.59 (s,1H) ; 8.36 (d,1H). |
| 1.25-206 | [CDCl ₃] 1.48 (t,1H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 4.15 (q,2H) ; 4.32-4.43 (m,2H) ; 6.92 (s br,1H) ; 7.31 (s,1H) ; 7.40 (s,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.46 (s,1H) ; 7.57 (s,1H). |
| 1.25-212 | [CDCl ₃] 1.45 (t,3H) ; 2.24 (s,3H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.33 (s,3H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.08 (q,2H) ; 4.28-4.38 (m,2H) ; 6.79 (t br,1H) ; 7.31 (s,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.57 (s,1H). |

分析數據表 1.29

| 編號 | NMR |
|---------------|--|
| 1.29-9 | [CDCl ₃] 2.37 (s,3H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.83-3.90 (m,2H) ; 4.02-4.13 (m,1H) ; 7.08 (s,1H) ; 7.40 (m,2H) ; 7.60 (s,1H). |
| 1.29-41 D1 | [CDCl ₃] D1 : 1.63 (d,3H) ; 2.37 (s,3H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H), 3.81-3.91 (m,1H) ; 4.95 (quint,1H) ; 7.03 (d,1H) ; 7.41 (m,2H) ; 7.61 (s,1H). |
| 1.29-41 D2 | [CDCl ₃] D2 : 1.63 (d,3H) ; 2.37 (s,3H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.95 (d,1H) ; 4.93 (quint,1H) ; 7.06 (d,1H) ; 7.40 (m,2H) ; 7.61 (s,1H). |
| 1.29-48 | [CDCl ₃] 1.40 (t,3H) ; 2.37 (s,3H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.77-3.89 (m,1H) ; 4.68-4.76 (m,1H) ; 6.86 (m,1H) ; 7.41 (m,2H) ; 7.61 (1H). |
| 1.29-60 | [CDCl ₃] 0.59 (m,2H) ; 0.83 (m,2H) ; 2.36 (s,3H) ; 2.82 (m,1H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.87 (d,1H) ; 6.80 (s,1H) ; 7.40 (m,2H) ; 7.60 (s,1H). |
| 1.29-73 | [CDCl ₃] 1.88 (m,1H), 2.28-2.35 (m,1H) ; 2.37 (s,3H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.72 (m,1H) ; 3.78-3.88 (m,3H) ; 3.98 (q,1H) ; 4.55 (m,1H) ; 6.93 (d,1H) ; 7.41 (s,2H) ; 7.61 (s,1H). |
| 1.29-93 | [CDCl ₃] 2.36 (s,3H) ; 2.61 (t,2H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.62 (q,2H) ; 3.72 (s,3H) ; 3.86 (d,1H) ; 7.40 (m,2H) ; 7.60 (s,1H). |
| 1.29-96 | [CDCl ₃] 1.25-1.31 (m,6H) ; 2.36 (s,3H) ; 2.57 (m,2H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.11-4.20 (m,2H) ; 4.39 (m,1H) ; 7.22 (s,1H) ; 7.41 (s,2H) ; 7.61 (s,1H) ; |
| 1.29-136 | [CDCl ₃] 2.37 (s,3H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.98 (d,1H), 4.53 (t,2H) ; 7.16 (d,1H), 7.26 (m,1H), 7.42 (s, 2H) ; 7.61 (s,1H) ; 8.36 (d, 1H). |
| 1.29-137 | [CDCl ₃] 2.37 (s,3H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.96 (d,1H) ; 4.57 (t,2H) ; 6.86 (s,1H) ; 7.11 (m,1H) ; 7.41 (s, 2H) ; 7.61 (s,1H) ; 8.20 (d,1H). |
| 1.29-142 | [CDCl ₃] 2.37 (s,3H), 3.37 (s,3H), 3.41 (d,1H) ; 3.89 (d,1H) ; 3.93 (s,3H) ; 4.46-4.51 (m,2H) ; 6.65 (s,1H) ; 6.80 (d,1H) ; 7.16 (s,1H) ; 7.41 (s,2H) ; 7.61 (s,1H) ; 8.12 (d,1H). |

| | |
|----------|--|
| 1.29-148 | [CDCl ₃] 1.30 (t,3H) ; 2.37 (s,3H) ; 2.82 (q,2H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.63 (d,1H) ; 4.51 (t,2H) ; 7.02 (d,1H) ; 7.08 (s,1H) ; 7.19 (s,1H) ; 7.41 (s,2H) ; 7.62 (s,1H) ; 8.50 (d,1H). |
| 1.29-149 | [CDCl ₃] 0.97-1.03 (m,4H) ; 2.00 (m,1H) ; 2.37 (s,3H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.94 (d,1H) ; 4.49 (m,2H) ; 6.96 (d,1H) ; 7.05 (s,1H) ; 7.14 (s,1H) ; 7.41 (s,2H) ; 7.61 (s,1H) ; 8.40 (d,1H). |
| 1.29-150 | [CDCl ₃] 0.96 (t,3H) ; 1.76 (sext,2H) ; 2.37 (s,3H) ; 2.75 (m,2H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.93 (d,1H) ; 4.50 (t,2H) ; 7.02 (d,1H) ; 7.06 (s,1H) ; 7.18 (s,1H) ; 7.41 (s,2H) ; 7.61 (s,1H) ; 8.50 (d,1H). |
| 1.29-152 | [CDCl ₃] 2.37 (s,3H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 3.96 (d,1H) ; 4.58-4.64 (m,2H) ; 7.30 (s,1H) ; 7.44 (m,3H) ; 7.61 (d,2H) ; 8.70 (d,1H). |
| 1.29-206 | [CDCl ₃] 1.48 (t,3H) ; 2.36 (s,3H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.38 (d,1H) ; 3.88 (d,1H) ; 4.16 (q,2H) ; 4.38 (m,2H) ; 6.93 (s,1H) ; 7.40 (s,3H) ; 7.46 (s,1H) ; 7.60 (s,1H). |
| 1.29-207 | [CDCl ₃] 2.36 (s,3H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.38 (d,1H) ; 3.88 (d,1H) ; 4.40 (t,2H) ; 4.67 (q,2H) ; 7.03 (s,1H) ; 7.41 (m,2H) ; 7.53 (s,1H) ; 7.56 (s,1H) ; 7.61 (s,1H). |
| 1.29-208 | [CDCl ₃] 2.36 (s,3H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.31-4.50 (m, 4H) ; 6.07 (tt,1H) ; 6.99 (t br,1H) ; 7.39 (s,2H) ; 7.48 (s,1H) ; 7.53 (s,1H) ; 7.60 (s,1H). |
| 1.29-212 | [CDCl ₃] 1.46 (t,3H) ; 2.25 (s,3H) ; 2.36 (s,3H) ; 3.34 (s,3H) ; 3.38 (d,1H) ; 3.88 (d,1H) ; 4.07 (q,2H) ; 4.33 (m,2H) ; 6.80 (s,1H) ; 7.31 (s,1H) ; 7.40 (s,2H) ; 7.61 (s,1H). |

分析數據表 1.32

| 編號 | NMR |
|----------|--|
| 1.32-1 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.41 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 5.68 (s br,1H) ; 6.66 (s br,1H) ; 7.47 (s,1H) ; 7.49 (s,1H) ; 7.73 (s,1H). |
| 1.32-9 | [CDCl ₃] 3.39 (s,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.88 (d,1H) ; 3.85-3.97 (m,1H) ; 4.01-4.18 (m,1H) ; 7.05 (t br,1H) ; 7.48 (s,1H) ; 7.49 (s,1H) ; 7.73 (s,1H). |
| 1.32-16 | 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.88 (d,1H) ; 3.90-4.05 (m,2H) ; 5.20 (d,1H) ; 5.24 (d,1H) ; 5.80-5.92 (m,1H) ; 6.85 (s br,1H) ; 7.47 (s,1H) ; 7.49 (s,1H) ; 7.73 (s,1H). |
| 1.32-60 | [CDCl ₃] 0.60 (m,2H) ; 0.84 (m,2H) ; 2.81 (m,1H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 6.78 (s br,1H) ; 7.46 (s,1H) ; 7.48 (s,1H) ; 7.72 (s,1H). |
| 1.32-94 | [CDCl ₃] 1.28 (t,3H) ; 2.59 (t,2H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.36 (s,3H) ; 3.62 (q,2H) ; 3.86 (d,1H) ; 4.18 (q,2H) ; 7.28 (s br,1H) ; 7.46 (s,1H) ; 7.48 (s,1H) ; 7.73 (s,1H). |
| 1.32-96 | [CDCl ₃] 1.22-1.33 (m,6H) ; 2.49-2.12 (m,2H) ; 3.33 (d,1H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.84 (d,1H) ; 4.10-4.23 (m,2H) ; 4.34-4.44 (m,1H) ; 7.25 (s br,1H) ; 7.46 (s,1H) ; 7.49 (s,1H) ; 7.73 (s,1H). |
| 1.32-102 | [CDCl ₃] 1.92 (pent,2H) ; 2.40 (t,2H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.40 (s,3H) ; 3.35-3.44 (m,2H) ; 3.69 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 6.92 (s br,1H) ; 7.46 (s,1H) ; 7.49 (s,1H) ; 7.73 (s,1H). |
| 1.32-110 | [CDCl ₃] 3.34 (d,1H) ; 3.37 (s,3H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.46-4.59 (m,2H) ; 7.15 (t br,1H) ; 7.33 (d,1H) ; 7.47 (s,1H) ; 7.49 (s,1H) ; 7.64 (d,1H) ; 7.73 (s,1H) ; 8.35 (s,1H). |

| | |
|----------|--|
| 1.32-136 | [CDCl ₃] 3.37 (d,1H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.99 (d,1H) ; 4.48-4.58 (m,2H) ; 7.16 (d,1H) ; 7.24 (s br,1H) ; 7.48 (s,1H) ; 7.51 (s,1H) ; 7.75 (s,1H) ; 8.36 (d,1H). |
| 1.32-206 | [CDCl ₃] 1.48 (t,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.15 (q,2H) ; 4.31-4.43 (m,2H) ; 6.92 (s br,1H) ; 7.41 (s,1H) ; 7.47 (s,2H) ; 7.48 (s,1H) ; 7.72 (s,1H). |
| 1.32-212 | [CDCl ₃] 1.44 (t,3H) ; 2.25 (s,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.88 (d,1H) ; 4.03-4.18 (m,2H) ; 4.28-4.38 (m,2H) ; 6.79 (s br,1H) ; 7.32 (s,1H) ; 7.46 (s,1H) ; 7.72 (s,1H). |

分析數據表 1.33

| 編號 | NMR |
|----------|--|
| 1.33-1 | [CDCl ₃] 3.40 (d,1H) ; 3.41 (s,3H) ; 3.93 (d,1H) ; 5.64 (s br,1H) ; 6.66 (s br,1H) ; 7.84 (s,1H) ; 7.85 (s,1H) ; 8.01 (s,1H). |
| 1.33-9 | 3.38 (s,3H) ; 3.43 (d,1H) ; 3.83-3.98 (m,1H) ; 3.42 (d,1H) ; 4.03-4.18 (m,1H) ; 7.06 (s br,1H) ; 7.85 (s,2H) ; 8.01 (s,1H). |
| 1.33-16 | [CDCl ₃] 3.38 (s,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.91 (d,1H) ; 3.91-4.06 (m,2H) ; 5.20 (d,1H) ; 5.28 (d,1H) ; 5.80-5.92 (m,1H) ; 6.84 (s br,1H) ; 7.83 (s,1H) ; 7.84 (s,1H) ; 8.00 (s,1H). |
| 1.33-60 | [CDCl ₃] 0.60 (m,2H) ; 0.84 (m,2H) ; 2.81 (m,1H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.91 (d,1H) ; 6.79 (s br,1H) ; 7.83 (s,1H) ; 7.84 (s,1H) ; 7.99 (s,1H). |
| 1.33-94 | [CDCl ₃] 1.28 (t,3H) ; 2.56 (t,2H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.63 (q,2H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.18 (q,2H) ; 7.28 (s br,1H) ; 7.83 (s,1H) ; 7.84 (s,1H) ; 8.00 (s,1H). |
| 1.33-96 | [CDCl ₃] 1.24-1.35 (m,6H) ; 2.50-2.64 (m,2H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.89 (d,1H) ; 4.12-4.23 (m,2H) ; 4.34-4.45 (m,1H) ; 7.27 (s br,1H) ; 7.83 (s,1H) ; 7.85 (s,1H) ; 8.00 (s,1H). |
| 1.33-102 | [CDCl ₃] 1.92 (pent,2H) ; 2.40 (t,2H) ; 3.39 (s,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.39 (t,2H) ; 3.69 (s,3H) ; 3.91 (d,1H) ; 6.93 (s br,1H) ; 7.83 (s,1H) ; 7.85 (s,1H) ; 8.00 (s,1H). |
| 1.33-110 | [CDCl ₃] 3.36 (s,3H) ; 3.38 (d,1H) ; 3.97 (d,1H) ; 4.45-4.59 (m,2H) ; 7.15 (t br,1H) ; 7.33 (d,1H) ; 7.65 (dd,1H) ; 7.84 (s,2H) ; 8.00 (s,1H) ; 8.36 (d,1H). |
| 1.33-136 | [CDCl ₃] 3.39 (s,3H) ; 3.41 (d,1H) ; 4.03 (d,1H) ; 4.49-4.59 (m,2H) ; 7.17 (d,1H) ; 7.25 (s br,1H) ; 7.85 (s,1H) ; 7.86 (s,1H) ; 8.02 (s,1H) ; 8.37 (d,1H). |
| 1.33-206 | [CDCl ₃] 1.49 (t,3H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.92 (d,1H) ; 4.15 (q,2H) ; 4.32-4.43 (m,2H) ; 6.92 (s br,1H) ; 7.41 (s,1H) ; 7.46 (s,1H) ; 7.84 (s,2H) ; 8.00 (s,1H). |
| 1.33-212 | [CDCl ₃] 1.46 (t,3H) ; 2.25 (s,3H) ; 3.35 (s,3H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.43 (d,1H) ; 4.08 (q,2H) ; 4.26-4.38 (m,2H) ; 6.79 (s br,1H) ; 7.31 (s,1H) ; 7.83 (s,1H) ; 7.84 (s,1H) ; 8.00 (s,1H). |

分析數據表 1.56

| 編號 | NMR |
|----------|--|
| 1.56-260 | [CDCl ₃] 1.26 (t,3H) ; 2.70 (q,2H) ; 3.47 (s,3H) ; 3.53 (d,1H) ; 4.03 (d,1H) ; 7.28 (d,2H) ; 7.61 (d,2H) ; 8.51 (s br,1H). |

| | |
|----------|---|
| 1.56-261 | [CDCl ₃] 1.26 (t,3H) ; 2.70 (q,2H) ; 3.48 (s,3H) ; 3.55 (d,1H) ; 4.01 (d,1H) ; 7.27 (d,2H) ; 7.61 (d,2H) ; 8.57 (s br,1H). |
| 1.56-262 | [CDCl ₃] 1.26 (t,3H) ; 2.70 (q,2H) ; 3.47 (d,1H) ; 3.48 (s,3H) ; 4.08 (d,1H) ; 7.20-7.30 (m,2H) ; 7.6-7.66 (m,4H) ; 8.44 (d,1H) ; 9.20 (s br,1H). |
| 1.56-263 | [CDCl ₃] 1.26 (t,3H) ; 2.69 (q,2H) ; 3.45 (s,3H) ; 3.49 (d,1H) ; 4.00 (d,1H) ; 7.27 (d,2H) ; 7.62 (m,4H) ; 7.75 (d,2H) ; 8.67 (s br,1H). |

分析數據表 1.57

| 編號 | NMR |
|----------|--|
| 1.57-264 | [CDCl ₃] 3.37 (d,1H) ; 3.60 (s,3H) ; 4.05 (d,1H) ; 7.23 (d,2H) ; 7.36 (d,1H) ; 7.51 (d,1H) ; 7.67 (d,2H) ; 8.58 (s br,1H). |
| 1.57-265 | [CDCl ₃] 3.36 (d,1H) ; 3.59 (s,3H) ; 4.05 (d,1H) ; 7.36 (d,1H) ; 7.45-7.56 (m,5H) ; 8.53 (s br,1H). |

分析數據表 2.2

| 編號 | NMR |
|---------|--|
| 2.2-1 | [CDCl ₃] 1.26 (t,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.63 (m,2H) ; 3.86 (d,1H) ; 5.70 (s br,1H) ; 6.70 (s br,1H) ; 7.16 (m,1H) ; 7.40 (m,3H). |
| 2.2-9 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 3.43 (d,1H) ; 3.60 (q,2H) ; 3.82 (d,1H) ; 3.90 (m,1H) ; 4.03-4.14 (m,1H) ; 7.10 (s br,1H) ; 7.13-7.18 (m,1H) ; 7.40 (m,3H). |
| 2.2-16 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.60 (m,2H) ; 3.85 (d,1H) ; 3.90-4.02 (m,2H) ; 5.17-5.27 (m,2H) ; 5.87 (m,1H) ; 6.90 (s br,1H) ; 7.17 (m,1H) ; 7.40 (m,3H). |
| 2.2-60 | [CDCl ₃] 0.60 (m,2H) ; 0.82 (m,2H) ; 1.24 (t,3H) ; 2.80 (m,2H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.58 (m,2H) ; 3.82 (d,1H) ; 6.82 (s br,1H) ; 7.15 (m,1H) ; 7.41 (m,2H). |
| 2.2-94 | [CDCl ₃] 1.26 (m,6H) ; 2.59 (t,2H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.60 (m,4H) ; 3.82 (d,1H) ; 4.18 (q,2H) ; 7.14 (m,1H) ; 7.31 (s br,1H) ; 7.40 (m,3H). |
| 2.2-96 | [CDCl ₃] 1.23-1.31 (m,9H) ; 2.56 (m,2H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.60 (m,2H) ; 3.80 (d,1H) ; 4.18 (m,2H) ; 4.40 (m,1H) ; 7.13 (m,1H) ; 7.27 (s br,1H) ; 7.40 (m,3H). |
| 2.2-102 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 1.92 (quin,2H) ; 2.40 (t,2H) ; 3.39 (m,3H) ; 3.57 (m,2H) ; 3.70 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 6.98 (s br,1H) ; 7.16 (m,1H) ; 7.40 (m,3H). |
| 2.2-206 | [CDCl ₃] 1.24 (t,3H) ; 1.48 (t,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.58 (m,2H) ; 3.84 (d,1H) ; 4.16 (q,2H) ; 4.39 (d,2H) ; 6.98 (s br,1H) ; 7.12 (m,1H) ; 7.40 (m,4H) ; 7.46 (s,1H). |
| 2.2-212 | [CDCl ₃] 1.23 (t,3H) ; 1.44 (m,3H) ; 2.26 (s,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.58 (m,2H) ; 3.82 (d,1H) ; 4.08 (m,2H) ; 4.33 (d,2H) ; 6.85 (s br,1H) ; 7.15 (m,1H) ; 7.30 (s,1H) ; 7.40 (m,3H). |

分析數據表 2.5

| 編號 | NMR |
|-------|---|
| 2.5-9 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 2.40 (s,3H) ; 3.48 (d,1H) ; 3.60 (q,2H) ; 3.83 (d,1H) ; 3.86-3.95 (m,1H) ; 4.05-4.12 (m,1H) ; 7.10 (s br,1H) ; 7.30 (m,2H) ; 7.45 (d,1H) ; |

| 編號 | NMR |
|---------|--|
| | 7.51 (s,1H). |
| 2.5-16 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 2.39 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.61 (q,2H) ; 3.85 (d,1H) ; 3.92-4.02 (m,2H) ; 5.17-5.30 (m,2H) ; 5.82-5.92 (m,1H) ; 6.90 (s br,1H) ; 7.24-7.33 (m,2H) ; 7.44 (d,1H) ; 7.51 (s,1H). |
| 2.5-60 | [CDCl ₃] 0.58 (m,2H) ; 0.84 (m,2H) ; 1.23 (t,3H) ; 2.39 (s,3H) ; 2.82 (m,1H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.58 (m,2H) ; 3.84 (d,1H) ; 6.85 (s br,1H) ; 7.24-7.32 (m,2H) ; 7.43 (d,1H) ; 7.50 (s,1H). |
| 2.5-94 | [CDCl ₃] 1.22-1.29 (m,6H) ; 2.38 (s,3H) ; 2.61 (t,2H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.55-3.63 (m,4H) ; 3.84 (d,1H) ; 4.19 (q,2H) ; 7.24-7.32 (m,3H) ; 7.44 (d,1H) ; 7.51 (s,1H). |
| 2.5-96 | [CDCl ₃] 1.22-1.31 (m,9H) ; 2.38 (s,3H) ; 2.57 (m,2H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.60 (m,2H) ; 3.80 (d,1H) ; 4.11-4.20 (m,2H) ; 4.43 (m,1H) ; 7.24-7.32 (m,2H) ; 7.45 (d,1H) ; 7.51 (s,1H). |
| 2.5-102 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 1.91 (quin,2H) ; 2.39 (m,5H) ; 3.36-3.44 (m,3H) ; 3.57 (m,2H) ; 3.69 (s,3H) ; 3.84 (d,1H) ; 6.98 (s br,1H) ; 7.24-7.33 (m,2H) ; 7.45 (d,1H) ; 7.51 (s,1H). |
| 2.5-206 | [CDCl ₃] 1.23 (t,3H) ; 1.48 (t,3H) ; 2.39 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.57 (m,2H) ; 3.83 (d,1H), 4.15 (q,2H) ; 4.38 (d,2H) ; 6.99 (s br,1H) ; 7.22-7.32 (m,2H) ; 7.40-7.46 (m,3H) ; 7.50 (s,1H). |
| 2.5-212 | [CDCl ₃] 1.22 (t,3H) ; 1.45 (t,3H) ; 2.26 (s,3H) ; 2.39 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.58 (m,2H) ; 3.84 (d,1H) ; 4.07 (m,2H) ; 4.32 (d,2H) ; 6.86 (s br,1H) ; 7.22-7.30 (m,3H) ; 7.43 (m,1H) ; 7.50 (s,1H). |

分析數據表 2.11

| 編號 | NMR |
|----------|---|
| 2.11-4 | [CDCl ₃] 0.98 (t,3H) ; 1.27 (t,3H) ; 1.62 (q,2H) ; 3.22-3.38 (m,2H) ; 3.37 (d,1H) ; 3.52-3.65 (m,2H) ; 3.80 (d,1H) ; 6.80 (s br,1H) ; 6.89 (t,1H) ; 7.19 (d,2H). |
| 2.11-9 | [CDCl ₃] 1.29 (t,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.53-3.65 (m,2H) ; 3.82 (d,1H) ; 3.85-3.98 (m,1H) ; 4.01-4.15 (m,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.05 (t br,1H) ; 7.20 (d,2H). |
| 2.11-60 | [CDCl ₃] 0.59 (t,2H) ; 0.87 (m,2H) ; 1.26 (t,3H) ; 2.81 (m,1H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.50-3.63 (m,2H) ; 3.82 (d,1H) ; 6.80 (s br,1H) ; 6.89 (t,1H) ; 7.18 (d,2H). |
| 2.11-93 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 2.60 (t,2H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.50-3.60 (m,2H) ; 3.62 (q,2H) ; 3.71 (s,3H) ; 3.82 (d,1H) ; 6.89 (t,1H) ; 7.18 (d,2H) ; 7.28 (t br,1H). |
| 2.11-96 | [CDCl ₃] 1.22-1.36 (m,9H) ; 2.50-2.61 (m,2H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.53-3.65 (m,2H) ; 3.80 (d,1H) ; 4.11-4.22 (m,2H) ; 4.34-4.45 (m,1H) ; 6.89 (t,1H) ; 7.18 (d,2H) ; 7.25 (s br,1H). |
| 2.11-102 | [CDCl ₃] 1.26 (t,3H) ; 1.93 (q,2H) ; 2.40 (t,2H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.40 (q,2H) ; 3.51-3.65 (m,2H) ; 3.69 (s,3H) ; 3.83 (d,1H) ; 6.85-6.93 (m,1H) ; 6.95 (t br,1H) ; 7.19 (d,2H). |
| 2.11-135 | [CDCl ₃] 1.28 (t,3H) ; 3.38 (d,1H) ; 3.50-3.70 (m,2H) ; 3.95 (d,1H) ; 4.62 (t,2H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.20 (d,2H) ; 7.38 (t br,1H) ; 7.45 (d,2H) ; 8.68 (d,2H). |

| 編號 | NMR |
|----------|---|
| 2.11-206 | [CDCl ₃] 1.27 (t,3H) ; 1.49 (t,3H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.50-3.63 (m,2H) ; 3.83 (d,1H) ; 4.15 (q,2H) ; 4.38 (d,2H) ; 6.89 (t,1H) ; 6.95 (t br,1H) ; 7.18 (d,2H) ; 7.40 (s,1H) ; 7.46 (s,1H). |
| 2.11-212 | [CDCl ₃] 1.24 (t,3H) ; 1.48 (t,3H) ; 2.25 (s,3H) ; 3.35 (d,1H) ; 3.50-3.64 (m,2H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.08 (q,2H) ; 4.34 (d,2H) ; 6.82 (t,1H) ; 6.90 (t,1H) ; 7.18 (d,2H) ; 7.32 (s,1H). |

分析數據表 2.20

| 編號 | NMR |
|----------|---|
| 2.20-4 | [CDCl ₃] 0.96 (t,3H) ; 1.25 (t,3H) ; 1.55-1.64 (m,2H) ; 3.23-3.35 (m,2H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.51-3.65 (m,2H) ; 3.80 (d,1H) ; 6.79 (t br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 2.20-9 | [CDCl ₃] 1.27 (t,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.52-3.65 (m,2H) ; 3.83 (d,1H) ; 3.83-3.97 (m,1H) ; 4.01-4.18 (m,1H) ; 7.05 (t br,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 2.20-60 | [CDCl ₃] 0.60 (m,2H) ; 0.85 (m,2H) ; 1.24 (t,3H) ; 2.80 (m,1H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.50-3.63 (m,2H) ; 3.84 (d,1H) ; 6.80 (s br,1H) ; 7.42 (s,1H) ; 7.54 (s,2H). |
| 2.20-93 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 2.61 (t,2H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.50-3.65 (m,4H) ; 3.72 (s,3H) ; 3.83 (d,1H) ; 7.30 (t br,1H) ; 7.42 (s,1H) ; 7.55 (d,2H). |
| 2.20-96 | [CDCl ₃] 1.23-1.31 (m,9H) ; 2.55 (m,2H) ; 3.31 (d,1H) ; 3.57 (m,2H) ; 3.80 (d,1H) ; 4.14 (m,2H) ; 4.39 (m,1H) ; 7.28 (s br,1H) ; 7.42 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 2.20-102 | [CDCl ₃] 1.26 (t,3H) ; 1.92 (quin,2H) ; 2.40 (t,2H) ; 3.32 (d,1H) ; 3.39 (q,2H) ; 3.50-3.64 (m,2H) ; 3.69 (s,3H) ; 3.83 (d,1H) ; 6.96 (t br,1H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 2.20-135 | [CDCl ₃] 1.27 (t,3H) ; 3.39 (d,1H) ; 3.52-3.67 (m,2H) ; 3.93 (d,1H) ; 4.55 (d,2H) ; 7.23 (m,3H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.56 (s,2H) ; 8.60 (d,2H). |
| 2.20-206 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 1.50 (t,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.50-3.64 (m,2H) ; 3.85 (d,1H) ; 4.15 (q,2H) ; 4.38 (d,2H) ; 6.95 (t br,1H) ; 7.40 (s,1H) ; 7.44 (s,1H) ; 7.48 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| 2.20-212 | [CDCl ₃] 1.23 (t,3H) ; 1.43 (t,3H) ; 2.26 (s,3H) ; 3.34 (d,1H) ; 3.48-3.64 (m,2H) ; 3.83 (d,1H) ; 4.08 (q,2H) ; 4.33(d,2H) ; 6.82 (s br,1H) ; 7.32 (s,1H) ; 7.42 (s,1H) ; 7.54 (s,2H). |

分析數據表 3.11

| 編號 | NMR |
|----------|--|
| 3.11-9 | [CDCl ₃] 3.41 (s,3H) ; 3.57 (d,1H), 4.08 (d,1H) ; 4.34 (m,1H) ; 4.62 (m,1H) ; 6.91 (m,1H) ; 7.20 (m,2H) ; 8.70 (s br,1H). |
| 3.11-60 | [CDCl ₃] 0.73 (m,2H) ; 1.01 (m,2H) ; 3.30 (m,1H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.54 (d,1H) ; 4.10 (d,1H) ; 6.90 (m,1H) ; 7.19 (m,2H) ; 8.50 (s br,1H). |
| 3.11-93 | [CDCl ₃] 2.76 (m,2H) ; 3.38 (s,3H) ; 3.51 (d,1H) ; 3.73 (s,3H) ; 4.02 (m,2H) ; 4.10 (d,1H), 6.90 (m,1H) ; 7.20 (m,2H) ; 9.12 (s br,1H). |
| 3.11-212 | [CDCl ₃] 1.47 (t,3H) ; 2.25 (s,3H), 3.38 (s,3H) ; 3.55 (d,1H), 4.09-4.14 (m,3H) ; 4.63 (m,2H) ; 6.90 (m,1H), 7.19 (m,2H) ; 7.39 (s,1H) ; 8.50 (s br,1H). |

表 A 說明通式(II)化合物，其中 R¹ 及 R² 分別為氫，及 X²、X³、X⁴、X⁵、X⁶、R³ 及 V 基團分別如表中之定義。

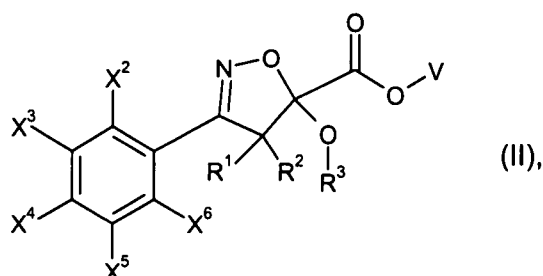


表 A：中間物

| 編號 | X ² | X ³ | X ⁴ | X ⁵ | X ⁶ | R ³ | V |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|
| A-1 | H | H | H | H | H | Me | H |
| A-2 | H | H | H | H | H | Me | Me |
| A-3 | H | H | H | H | H | Me | Et |
| A-4 | H | H | H | H | H | Et | H |
| A-5 | H | H | H | H | H | Et | Me |
| A-6 | H | H | H | H | H | Et | Et |
| A-7 | H | H | H | F | H | Me | H |
| A-8 | H | H | H | F | H | Me | Me |
| A-9 | H | H | H | F | H | Me | Et |
| A-10 | H | H | H | F | H | Et | H |
| A-11 | H | H | H | F | H | Et | Me |
| A-12 | H | H | H | F | H | Et | Et |
| A-13 | H | H | H | Cl | H | Me | H |
| A-14 | H | H | H | Cl | H | Me | Me |
| A-15 | H | H | H | Cl | H | Me | Et |
| A-16 | H | H | H | Cl | H | Et | H |

| 編號 | X ² | X ³ | X ⁴ | X ⁵ | X ⁶ | R ³ | V |
|------|----------------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----|
| A-17 | H | H | H | Cl | H | Et | Me |
| A-18 | H | H | H | Cl | H | Et | Et |
| A-19 | H | H | H | Br | H | Me | H |
| A-20 | H | H | H | Br | H | Me | Me |
| A-21 | H | H | H | Br | H | Me | Et |
| A-22 | H | H | H | Br | H | Et | H |
| A-23 | H | H | H | Br | H | Et | Me |
| A-24 | H | H | H | Br | H | Et | Et |
| A-25 | H | H | H | Me | H | Me | H |
| A-26 | H | H | H | Me | H | Me | Me |
| A-27 | H | H | H | Me | H | Me | Et |
| A-28 | H | H | H | Me | H | Et | H |
| A-29 | H | H | H | Me | H | Et | Me |
| A-30 | H | H | H | Me | H | Et | Et |
| A-31 | H | H | H | Et | H | Me | H |
| A-32 | H | H | H | Et | H | Me | Me |
| A-33 | H | H | H | Et | H | Me | Et |
| A-34 | H | H | H | Et | H | Et | H |
| A-35 | H | H | H | Et | H | Et | Me |
| A-36 | H | H | H | Et | H | Et | Et |
| A-37 | H | H | H | OMe | H | Me | H |
| A-38 | H | H | H | OMe | H | Me | Me |
| A-39 | H | H | H | OMe | H | Me | Et |
| A-40 | H | H | H | OMe | H | Et | H |
| A-41 | H | H | H | OMe | H | Et | Me |
| A-42 | H | H | H | OMe | H | Et | Et |
| A-43 | H | H | H | OCF ₃ | H | Me | H |
| A-44 | H | H | H | OCF ₃ | H | Me | Me |
| A-45 | H | H | H | OCF ₃ | H | Me | Et |
| A-46 | H | H | H | OCF ₃ | H | Et | H |
| A-47 | H | H | H | OCF ₃ | H | Et | Me |
| A-48 | H | H | H | OCF ₃ | H | Et | Et |
| A-49 | H | H | H | CF ₃ | H | Me | H |
| A-50 | H | H | H | CF ₃ | H | Me | Me |
| A-51 | H | H | H | CF ₃ | H | Me | Et |
| A-52 | H | H | H | CF ₃ | H | Et | H |
| A-53 | H | H | H | CF ₃ | H | Et | Me |
| A-54 | H | H | H | CF ₃ | H | Et | Et |
| A-55 | H | H | H | CN | H | Me | H |
| A-56 | H | H | H | CN | H | Me | Me |

| 編號 | X ² | X ³ | X ⁴ | X ⁵ | X ⁶ | R ³ | V |
|------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----------------|----|
| A-57 | H | H | H | CN | H | Me | Et |
| A-58 | H | H | H | CN | H | Et | H |
| A-59 | H | H | H | CN | H | Et | Me |
| A-60 | H | H | H | CN | H | Et | Et |
| A-61 | H | F | H | F | H | Me | H |
| A-62 | H | F | H | F | H | Me | Me |
| A-63 | H | F | H | F | H | Me | Et |
| A-64 | H | F | H | F | H | Et | H |
| A-65 | H | F | H | F | H | Et | Me |
| A-66 | H | F | H | F | H | Et | Et |
| A-67 | H | F | H | Cl | H | Me | H |
| A-68 | H | F | H | Cl | H | Me | Me |
| A-69 | H | F | H | Cl | H | Me | Et |
| A-70 | H | F | H | Cl | H | Et | H |
| A-71 | H | F | H | Cl | H | Et | Me |
| A-72 | H | F | H | Cl | H | Et | Et |
| A-73 | H | F | H | Br | H | Me | H |
| A-74 | H | F | H | Br | H | Me | Me |
| A-75 | H | F | H | Br | H | Me | Et |
| A-76 | H | F | H | Br | H | Et | H |
| A-77 | H | F | H | Br | H | Et | Me |
| A-78 | H | F | H | Br | H | Et | Et |
| A-79 | H | F | H | Me | H | Me | H |
| A-80 | H | F | H | Me | H | Me | Me |
| A-81 | H | F | H | Me | H | Me | Et |
| A-82 | H | F | H | Me | H | Et | H |
| A-83 | H | F | H | Me | H | Et | Me |
| A-84 | H | F | H | Me | H | Et | Et |
| A-85 | H | F | H | Et | H | Me | H |
| A-86 | H | F | H | Et | H | Me | Me |
| A-87 | H | F | H | Et | H | Me | Et |
| A-88 | H | F | H | Et | H | Et | H |
| A-89 | H | F | H | Et | H | Et | Me |
| A-90 | H | F | H | Et | H | Et | Et |
| A-91 | H | F | H | OMe | H | Me | H |
| A-92 | H | F | H | OMe | H | Me | Me |
| A-93 | H | F | H | OMe | H | Me | Et |
| A-94 | H | F | H | OMe | H | Et | H |
| A-95 | H | F | H | OMe | H | Et | Me |
| A-96 | H | F | H | OMe | H | Et | Et |

| 編號 | X ² | X ³ | X ⁴ | X ⁵ | X ⁶ | R ³ | V |
|-------|----------------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----|
| A-97 | H | F | H | OCF ₃ | H | Me | H |
| A-98 | H | F | H | OCF ₃ | H | Me | Me |
| A-99 | H | F | H | OCF ₃ | H | Me | Et |
| A-100 | H | F | H | OCF ₃ | H | Et | H |
| A-101 | H | F | H | OCF ₃ | H | Et | Me |
| A-102 | H | F | H | OCF ₃ | H | Et | Et |
| A-103 | H | F | H | CF ₃ | H | Me | H |
| A-104 | H | F | H | CF ₃ | H | Me | Me |
| A-105 | H | F | H | CF ₃ | H | Me | Et |
| A-106 | H | F | H | CF ₃ | H | Et | H |
| A-107 | H | F | H | CF ₃ | H | Et | Me |
| A-108 | H | F | H | CF ₃ | H | Et | Et |
| A-109 | H | F | H | CN | H | Me | H |
| A-110 | H | F | H | CN | H | Me | Me |
| A-111 | H | F | H | CN | H | Me | Et |
| A-112 | H | F | H | CN | H | Et | H |
| A-113 | H | F | H | CN | H | Et | Me |
| A-114 | H | F | H | CN | H | Et | Et |
| A-115 | H | Cl | H | Cl | H | Me | H |
| A-116 | H | Cl | H | Cl | H | Me | Me |
| A-117 | H | Cl | H | Cl | H | Me | Et |
| A-118 | H | Cl | H | Cl | H | Et | H |
| A-119 | H | Cl | H | Cl | H | Et | Me |
| A-120 | H | Cl | H | Cl | H | Et | Et |
| A-121 | H | Cl | H | Br | H | Me | H |
| A-122 | H | Cl | H | Br | H | Me | Me |
| A-123 | H | Cl | H | Br | H | Me | Et |
| A-124 | H | Cl | H | Br | H | Et | H |
| A-125 | H | Cl | H | Br | H | Et | Me |
| A-126 | H | Cl | H | Br | H | Et | Et |
| A-127 | H | Cl | H | Me | H | Me | H |
| A-128 | H | Cl | H | Me | H | Me | Me |
| A-129 | H | Cl | H | Me | H | Me | Et |
| A-130 | H | Cl | H | Me | H | Et | H |
| A-131 | H | Cl | H | Me | H | Et | Me |
| A-132 | H | Cl | H | Me | H | Et | Et |
| A-133 | H | Cl | H | Et | H | Me | H |
| A-134 | H | Cl | H | Et | H | Me | Me |
| A-135 | H | Cl | H | Et | H | Me | Et |
| A-136 | H | Cl | H | Et | H | Et | H |

| 編號 | X ² | X ³ | X ⁴ | X ⁵ | X ⁶ | R ³ | V |
|-------|----------------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----|
| A-137 | H | Cl | H | Et | H | Et | Me |
| A-138 | H | Cl | H | Et | H | Et | Et |
| A-139 | H | Cl | H | OMe | H | Me | H |
| A-140 | H | Cl | H | OMe | H | Me | Me |
| A-141 | H | Cl | H | OMe | H | Me | Et |
| A-142 | H | Cl | H | OMe | H | Et | H |
| A-143 | H | Cl | H | OMe | H | Et | Me |
| A-144 | H | Cl | H | OMe | H | Et | Et |
| A-145 | H | Cl | H | OCF ₃ | H | Me | H |
| A-146 | H | Cl | H | OCF ₃ | H | Me | Me |
| A-147 | H | Cl | H | OCF ₃ | H | Me | Et |
| A-148 | H | Cl | H | OCF ₃ | H | Et | H |
| A-149 | H | Cl | H | OCF ₃ | H | Et | Me |
| A-150 | H | Cl | H | OCF ₃ | H | Et | Et |
| A-151 | H | Cl | H | CF ₃ | H | Me | H |
| A-152 | H | Cl | H | CF ₃ | H | Me | Me |
| A-153 | H | Cl | H | CF ₃ | H | Me | Et |
| A-154 | H | Cl | H | CF ₃ | H | Et | H |
| A-155 | H | Cl | H | CF ₃ | H | Et | Me |
| A-156 | H | Cl | H | CF ₃ | H | Et | Et |
| A-157 | H | Cl | H | CN | H | Me | H |
| A-158 | H | Cl | H | CN | H | Me | Me |
| A-159 | H | Cl | H | CN | H | Me | Et |
| A-160 | H | Cl | H | CN | H | Et | H |
| A-161 | H | Cl | H | CN | H | Et | Me |
| A-162 | H | Cl | H | CN | H | Et | Et |
| A-163 | H | Br | H | Br | H | Me | H |
| A-164 | H | Br | H | Br | H | Me | Me |
| A-165 | H | Br | H | Br | H | Me | Et |
| A-166 | H | Br | H | Br | H | Et | H |
| A-167 | H | Br | H | Br | H | Et | Me |
| A-168 | H | Br | H | Br | H | Et | Et |
| A-169 | H | Br | H | Me | H | Me | H |
| A-170 | H | Br | H | Me | H | Me | Me |
| A-171 | H | Br | H | Me | H | Me | Et |
| A-172 | H | Br | H | Me | H | Et | H |
| A-173 | H | Br | H | Me | H | Et | Me |
| A-174 | H | Br | H | Me | H | Et | Et |
| A-175 | H | Br | H | Et | H | Me | H |
| A-176 | H | Br | H | Et | H | Me | Me |

| 編號 | X ² | X ³ | X ⁴ | X ⁵ | X ⁶ | R ³ | V |
|-------|----------------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----|
| A-177 | H | Br | H | Et | H | Me | Et |
| A-178 | H | Br | H | Et | H | Et | H |
| A-179 | H | Br | H | Et | H | Et | Me |
| A-180 | H | Br | H | Et | H | Et | Et |
| A-181 | H | Br | H | OMe | H | Me | H |
| A-182 | H | Br | H | OMe | H | Me | Me |
| A-183 | H | Br | H | OMe | H | Me | Et |
| A-184 | H | Br | H | OMe | H | Et | H |
| A-185 | H | Br | H | OMe | H | Et | Me |
| A-186 | H | Br | H | OMe | H | Et | Et |
| A-187 | H | Br | H | OCF ₃ | H | Me | H |
| A-188 | H | Br | H | OCF ₃ | H | Me | Me |
| A-189 | H | Br | H | OCF ₃ | H | Me | Et |
| A-190 | H | Br | H | OCF ₃ | H | Et | H |
| A-191 | H | Br | H | OCF ₃ | H | Et | Me |
| A-192 | H | Br | H | OCF ₃ | H | Et | Et |
| A-193 | H | Br | H | CF ₃ | H | Me | H |
| A-194 | H | Br | H | CF ₃ | H | Me | Me |
| A-195 | H | Br | H | CF ₃ | H | Me | Et |
| A-196 | H | Br | H | CF ₃ | H | Et | H |
| A-197 | H | Br | H | CF ₃ | H | Et | Me |
| A-198 | H | Br | H | CF ₃ | H | Et | Et |
| A-199 | H | Br | H | CN | H | Me | H |
| A-200 | H | Br | H | CN | H | Me | Me |
| A-201 | H | Br | H | CN | H | Me | Et |
| A-202 | H | Br | H | CN | H | Et | H |
| A-203 | H | Br | H | CN | H | Et | Me |
| A-204 | H | Br | H | CN | H | Et | Et |
| A-205 | H | Me | H | Me | H | Me | H |
| A-206 | H | Me | H | Me | H | Me | Me |
| A-207 | H | Me | H | Me | H | Me | Et |
| A-208 | H | Me | H | Me | H | Et | H |
| A-209 | H | Me | H | Me | H | Et | Me |
| A-210 | H | Me | H | Me | H | Et | Et |
| A-211 | H | Me | H | Et | H | Me | H |
| A-212 | H | Me | H | Et | H | Me | Me |
| A-213 | H | Me | H | Et | H | Me | Et |
| A-214 | H | Me | H | Et | H | Et | H |
| A-215 | H | Me | H | Et | H | Et | Me |
| A-216 | H | Me | H | Et | H | Et | Et |

| 編號 | X ² | X ³ | X ⁴ | X ⁵ | X ⁶ | R ³ | V |
|-------|----------------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----|
| A-217 | H | Me | H | OMe | H | Me | H |
| A-218 | H | Me | H | OMe | H | Me | Me |
| A-219 | H | Me | H | OMe | H | Me | Et |
| A-220 | H | Me | H | OMe | H | Et | H |
| A-221 | H | Me | H | OMe | H | Et | Me |
| A-222 | H | Me | H | OMe | H | Et | Et |
| A-223 | H | Me | H | OCF ₃ | H | Me | H |
| A-224 | H | Me | H | OCF ₃ | H | Me | Me |
| A-225 | H | Me | H | OCF ₃ | H | Me | Et |
| A-226 | H | Me | H | OCF ₃ | H | Et | H |
| A-227 | H | Me | H | OCF ₃ | H | Et | Me |
| A-228 | H | Me | H | OCF ₃ | H | Et | Et |
| A-229 | H | Me | H | CF ₃ | H | Me | H |
| A-230 | H | Me | H | CF ₃ | H | Me | Me |
| A-231 | H | Me | H | CF ₃ | H | Me | Et |
| A-232 | H | Me | H | CF ₃ | H | Et | H |
| A-233 | H | Me | H | CF ₃ | H | Et | Me |
| A-234 | H | Me | H | CF ₃ | H | Et | Et |
| A-235 | H | Me | H | CN | H | Me | H |
| A-236 | H | Me | H | CN | H | Me | Me |
| A-237 | H | Me | H | CN | H | Me | Et |
| A-238 | H | Me | H | CN | H | Et | H |
| A-239 | H | Me | H | CN | H | Et | Me |
| A-240 | H | Me | H | CN | H | Et | Et |
| A-241 | H | Et | H | Et | H | Me | H |
| A-242 | H | Et | H | Et | H | Me | Me |
| A-243 | H | Et | H | Et | H | Me | Et |
| A-244 | H | Et | H | Et | H | Et | H |
| A-245 | H | Et | H | Et | H | Et | Me |
| A-246 | H | Et | H | Et | H | Et | Et |
| A-247 | H | Et | H | OMe | H | Me | H |
| A-248 | H | Et | H | OMe | H | Me | Me |
| A-249 | H | Et | H | OMe | H | Me | Et |
| A-250 | H | Et | H | OMe | H | Et | H |
| A-251 | H | Et | H | OMe | H | Et | Me |
| A-252 | H | Et | H | OMe | H | Et | Et |
| A-253 | H | Et | H | OCF ₃ | H | Me | H |
| A-254 | H | Et | H | OCF ₃ | H | Me | Me |
| A-255 | H | Et | H | OCF ₃ | H | Me | Et |
| A-256 | H | Et | H | OCF ₃ | H | Et | H |

| 編號 | X ² | X ³ | X ⁴ | X ⁵ | X ⁶ | R ³ | V |
|-------|----------------|------------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----|
| A-257 | H | Et | H | OCF ₃ | H | Et | Me |
| A-258 | H | Et | H | OCF ₃ | H | Et | Et |
| A-259 | H | Et | H | CF ₃ | H | Me | H |
| A-260 | H | Et | H | CF ₃ | H | Me | Me |
| A-261 | H | Et | H | CF ₃ | H | Me | Et |
| A-262 | H | Et | H | CF ₃ | H | Et | H |
| A-263 | H | Et | H | CF ₃ | H | Et | Me |
| A-264 | H | Et | H | CF ₃ | H | Et | Et |
| A-265 | H | Et | H | CN | H | Me | H |
| A-266 | H | Et | H | CN | H | Me | Me |
| A-267 | H | Et | H | CN | H | Me | Et |
| A-268 | H | Et | H | CN | H | Et | H |
| A-269 | H | Et | H | CN | H | Et | Me |
| A-270 | H | Et | H | CN | H | Et | Et |
| A-271 | H | OMe | H | OMe | H | Me | H |
| A-272 | H | OMe | H | OMe | H | Me | Me |
| A-273 | H | OMe | H | OMe | H | Me | Et |
| A-274 | H | OMe | H | OMe | H | Et | H |
| A-275 | H | OMe | H | OMe | H | Et | Me |
| A-276 | H | OMe | H | OMe | H | Et | Et |
| A-277 | H | OMe | H | OCF ₃ | H | Me | H |
| A-278 | H | OMe | H | OCF ₃ | H | Me | Me |
| A-279 | H | OMe | H | OCF ₃ | H | Me | Et |
| A-280 | H | OMe | H | OCF ₃ | H | Et | H |
| A-281 | H | OMe | H | OCF ₃ | H | Et | Me |
| A-282 | H | OMe | H | OCF ₃ | H | Et | Et |
| A-283 | H | OMe | H | CF ₃ | H | Me | H |
| A-284 | H | OMe | H | CF ₃ | H | Me | Me |
| A-285 | H | OMe | H | CF ₃ | H | Me | Et |
| A-286 | H | OMe | H | CF ₃ | H | Et | H |
| A-287 | H | OMe | H | CF ₃ | H | Et | Me |
| A-288 | H | OMe | H | CF ₃ | H | Et | Et |
| A-289 | H | OMe | H | CN | H | Me | H |
| A-290 | H | OMe | H | CN | H | Me | Me |
| A-291 | H | OMe | H | CN | H | Me | Et |
| A-292 | H | OMe | H | CN | H | Et | H |
| A-293 | H | OMe | H | CN | H | Et | Me |
| A-294 | H | OMe | H | CN | H | Et | Et |
| A-295 | H | OCF ₃ | H | OCF ₃ | H | Me | H |
| A-296 | H | OCF ₃ | H | OCF ₃ | H | Me | Me |

| 編號 | X ² | X ³ | X ⁴ | X ⁵ | X ⁶ | R ³ | V |
|-------|----------------|------------------|----------------|------------------|----------------|----------------|----|
| A-297 | H | OCF ₃ | H | OCF ₃ | H | Me | Et |
| A-298 | H | OCF ₃ | H | OCF ₃ | H | Et | H |
| A-299 | H | OCF ₃ | H | OCF ₃ | H | Et | Me |
| A-300 | H | OCF ₃ | H | OCF ₃ | H | Et | Et |
| A-301 | H | OCF ₃ | H | CF ₃ | H | Me | H |
| A-302 | H | OCF ₃ | H | CF ₃ | H | Me | Me |
| A-303 | H | OCF ₃ | H | CF ₃ | H | Me | Et |
| A-304 | H | OCF ₃ | H | CF ₃ | H | Et | H |
| A-305 | H | OCF ₃ | H | CF ₃ | H | Et | Me |
| A-306 | H | OCF ₃ | H | CF ₃ | H | Et | Et |
| A-307 | H | OCF ₃ | H | CN | H | Me | H |
| A-308 | H | OCF ₃ | H | CN | H | Me | Me |
| A-309 | H | OCF ₃ | H | CN | H | Me | Et |
| A-310 | H | OCF ₃ | H | CN | H | Et | H |
| A-311 | H | OCF ₃ | H | CN | H | Et | Me |
| A-312 | H | OCF ₃ | H | CN | H | Et | Et |
| A-313 | H | CF ₃ | H | CF ₃ | H | Me | H |
| A-314 | H | CF ₃ | H | CF ₃ | H | Me | Me |
| A-315 | H | CF ₃ | H | CF ₃ | H | Me | Et |
| A-316 | H | CF ₃ | H | CF ₃ | H | Et | H |
| A-317 | H | CF ₃ | H | CF ₃ | H | Et | Me |
| A-318 | H | CF ₃ | H | CF ₃ | H | Et | Et |
| A-319 | H | CF ₃ | H | CN | H | Me | H |
| A-320 | H | CF ₃ | H | CN | H | Me | Me |
| A-321 | H | CF ₃ | H | CN | H | Me | Et |
| A-322 | H | CF ₃ | H | CN | H | Et | H |
| A-323 | H | CF ₃ | H | CN | H | Et | Me |
| A-324 | H | CF ₃ | H | CN | H | Et | Et |
| A-325 | H | CN | H | CN | H | Me | H |
| A-326 | H | CN | H | CN | H | Me | Me |
| A-327 | H | CN | H | CN | H | Me | Et |
| A-328 | H | CN | H | CN | H | Et | H |
| A-329 | H | CN | H | CN | H | Et | Me |
| A-330 | H | CN | H | CN | H | Et | Et |
| A-331 | H | H | Et | H | H | Me | H |
| A-332 | H | H | Et | H | H | Me | Me |
| A-333 | H | H | Et | H | H | Me | Et |
| A-334 | Cl | Cl | H | H | Cl | Me | H |
| A-335 | Cl | Cl | H | H | Cl | Me | Me |
| A-336 | Cl | Cl | H | H | Cl | Me | Et |

分析數據表 A :

| 編號 | NMR |
|------|---|
| A-1 | [CDCl ₃] 3.50 (s,3H); 3.50-3.55 (d,1H), 3.90 (d,1H), 7.45 (m,3H); 7.68 (m,2H). |
| A-2 | [CDCl ₃] 3.48 (d,1H); 3.48 (s,3H); 3.83 (d,1H); 3.89 (s,3H); 7.42 (m,3H); 7.68 (m,2H). |
| A-7 | [CDCl ₃] 3.49 (d,1H); 3.51 (s,3H); 3.90 (d,1H); 7.18 (m,1H); 7.42-7.51 (m,2H); 7.60 (m,1H). |
| A-8 | [CDCl ₃] 3.45 (d,1H), 3.48 (s,3H); 3.80 (d,1H); 3.89 (s,3H); 7.16 (m,1H); 7.37-7.43 (m,3H). |
| A-10 | [CDCl ₃] 1.27 (m,3H); 3.50 (d,1H), 3.77 (q,2H); 3.88 (d,1H), 5.74 (s br, 1H); 7.16 (m,1H), 7.40 (m,2H); 7.60 (m,1H). |
| A-12 | [CDCl ₃] 1.23 (t,3H); 1.36 (t,3H); 3.42 (d,1H); 3.70-3.85 (m,3H); 4.34 (m,2H); 7.13 (m,1H); 7.40 (m,3H). |
| A-13 | [CDCl ₃] 3.49 (d,1H); 3.50 (s,3H), 3.89 (d,1H); 7.39 (t,1H); 7.42 (d,1H); 7.56 (d,1H); 7.69 (s,1H). |
| A-14 | [CDCl ₃] 3.43 (d,1H); 3.48 (s,3H); 3.80 (d,1H); 3.89 (s,3H); 7.37 (t,1H); 7.41 (m,1H); 7.54 (m,1H); 7.67 (m,1H). |
| A-25 | [CDCl ₃] 2.39 (s,3H); 3.50 (s,3H); 3.54 (d,1H); 3.88 (d,1H); 7.30-7.68 (m,4H). |
| A-26 | [CDCl ₃] 2.38 (s,3H); 3.47 (s,3H); 3.44-3.49 (d,1H); 3.83 (d,1H); 3.89 (s,3H); 7.25-7.33 (m,2H), 7.45 (d,1H); 7.51 (s,1H). |
| A-30 | [CDCl ₃] 1.22 (t,3H); 1.35 (t,3H); 2.39 (s,3H); 3.49 (d,1H); 3.70-3.81 (m,3H); 4.33 (m,2H); 7.24-7.32 (m,2H); 7.45 (d,1H); 7.52 (s,1H). |
| A-31 | [CDCl ₃] 1.25 (m,3H); 2.69 (q,2H), 3.49 (s,3H); 3.50 (d,1H); 3.90 (d,1H), 7.30 (d,1H); 7.33 (t,1H); 7.46 (d,1H); 7.54 (s,1H). |
| A-32 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H); 2.68 (q,2H); 3.45-3.50 (d,1H), 3.47 (s,3H); 3.83 (d,1H); 3.88 (s,3H); 7.26-7.35 (m,2H); 7.45 (d,1H); 7.54 (s,1H). |
| A-36 | [CDCl ₃] 1.23 (m,6H); 1.35 (t,3H); 2.68 (q,2H); 3.49 (d,1H); 3.70-3.85 (m,3H); 4.43 (m,2H); 7.29-7.35 (m,2H); 7.45 (d,1H); 7.55 (s,1H). |
| A-37 | [CDCl ₃] 3.50 (s,3H); 3.51 (d,1H); 3.83 (s,3H); 3.90 (d,1H); 7.01 (d,1H); 7.19 (d,1H); 7.28 (s,1H); 7.33 (t,1H). |
| A-38 | [CDCl ₃] 3.44 (d,1H); 3.48 (s,3H); 3.79-3.87 (d,1H); 3.84 (s,3H); 3.89 (s,3H); 6.99 (d,1H); 7.17 (d,1H); 7.26-7.34 (m,2H). |
| A-42 | [CDCl ₃] 1.23 (t,3H); 1.36 (t,3H), 3.44 (d,1H); 3.70-3.80 (m,3H); 3.82 (s,3H); 4.32 (m,2H); 6.99 (d,1H); 7.19 (d,1H); 7.28-7.34 (m,2H). |
| A-62 | [CDCl ₃] 3.40 (d,1H); 3.48 (s,3H); 3.78 (d,1H); 3.89 (s,3H); 6.90 (t,1H); 7.20 (d,2H). |
| A-61 | [CDCl ₃] 3.45 (d,1H); 3.51 (s,3H); 3.86 (d,1H); 6.91 (m,1H); 7.21 (m,2H). |
| A-64 | [CDCl ₃] 1.27 (t,3H); 3.45 (d,1H), 3.75 (q,2H); 3.83 (d,1H); 6.90 (m,1H); 7.20 (m,2H). |

| | |
|-------|---|
| A-66 | [CDCl ₃] 1.23 (t,3H) ; 1.34 (t,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.70-3.77 (m,2H) ; 3.82 (m,1H) ; 4.35 (m,2H) ; 6.89 (m,1H) ; 7.20 (m,2H). |
| A-79 | [CDCl ₃] 2.39 (s,3H) ; 3.46 (d,1H) ; 3.49 (s,3H) ; 3.88 (d,1H) ; 6.99 (d,1H), 7.20 (d,1H) ; 7.25 (s,1H). |
| A-80 | [CDCl ₃] 2.38 (s,3H) ; 3.43 (d,1H), 3.47 (s,3H) ; 3.80 (d,1H), 3.90 (s,3H) ; 6.97 (d,1H) ; 7.19 (d,1H) ; 7.26 (s,1H). |
| A-84 | [CDCl ₃] 1.22 (t,3H) ; 1.35 (t,3H) ; 2.39 (s,3H) ; 3.42 (d,1H) ; 3.72 (m,2H) ; 3.80 (quin,1H) ; 4.33 (m,2H) ; 6.97 (d,1H) ; 7.20 (d,1H), 7.26 (s,1H). |
| A-91 | [CDCl ₃] 3.47 (d,1H) ; 3.50 (s,3H) ; 3.83 (s,3H) ; 3.85 (d,1H) ; 6.71 (d,1H) ; 6.96 (d,1H) ; 7.02 (s,1H). |
| A-92 | [CDCl ₃] 3.40 (d,1H) ; 3.48 (s,3H) ; 3.78 (d,1H), 3.83 (s,3H) ; 3.89 (s,3H) ; 6.70 (d,1H) ; 6.94 (d,1H) ; 7.02 (s,1H). |
| A-103 | [CDCl ₃] 3.46-3.51 (d,1H) ; 3.51 (s,3H) ; 3.92 (d,1H) ; 7.42 (d,1H) ; 7.61 (d,1H) ; 7.69 (s,1H). |
| A-104 | [CDCl ₃] 3.45 (d,1H) ; 3.50 (s,3H) ; 3.83 (d,1H) ; 3.90 (s,3H) ; 7.40 (d,1H) ; 7.60 (d,1H), 7.68 (s,1H). |
| A-115 | [CDCl ₃] 3.35 (d,1H) ; 3.41 (s,3H) ; 3.78 (d,1H) ; 7.38 (s,1H) ; 7.48 (s,2H). |
| A-116 | [CDCl ₃] 3.40 (d,1H) ; 3.48 (s,3H) ; 3.78 (d,1H) ; 3.89 (s,3H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.55 (s,2H). |
| A-118 | [CDCl ₃] 1.27 (t,3H), 3.45 (d,1H) ; 3.75 (q,2H) ; 3.85 (d,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| A-120 | [CDCl ₃] 1.23 (t,3H) ; 1.37 (t,3H) ; 3.40 (d,1H) ; 3.70-3.82 (m,3H) ; 4.35 (m,2H) ; 7.43 (s,1H) ; 7.56 (s,2H). |
| A-145 | [CDCl ₃] 3.45 (d,1H) ; 3.50 (s,3H) ; 3.87 (d,1H), 7.33 (s,1H), 7.46 (s,1H), 7.59 (s,1H). |
| A-146 | [CDCl ₃] 3.41 (d,1H) ; 3.49 (s,3H) ; 3.80 (d,1H) ; 3.89 (s,3H) ; 7.31 (s,1H) ; 7.45 (s,1H) ; 7.58 (s,1H). |
| A-169 | [CDCl ₃] 2.37 (s,3H), 3.47 (d,1H), 3.48 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 7.43 (s, 2H) ; 7.61 (s,1H). |
| A-170 | [CDCl ₃] 2.36 (s,3H) ; 3.41 (d,1H), 3.47 (s,3H), 3.79 (d,1H) ; 3.89 (s,3H) ; 7.42 (d,2H) ; 7.60 (s,1H). |
| A-187 | [CDCl ₃] 3.45 (d,1H) ; 3.50 (s,3H) ; 3.87 (d,1H) ; 7.49 (d,2H) ; 7.73 (s,1H). |
| A-188 | [CDCl ₃] 3.41 (d,1H) ; 3.49 (s,3H) ; 3.79 (d,1H) ; 3.89 (s,3H) ; 7.47 (s,1H) ; 7.50 (s,1H) ; 7.73 (s,1H). |
| A-193 | [CDCl ₃] 3.47 (d,1H), 3.50 (s,3H) ; 3.90 (d,1H) ; 7.85 (s,2H) ; 8.02 (s,1H). |
| A-194 | [CDCl ₃] 3.45 (d,1H) ; 3.49 (s,3H) ; 3.81 (d,1H) ; 3.90 (s,3H) ; 7.83 (m,2H) ; 8.01 (s,1H). |
| A-331 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 2.69 (q,2H) ; 3.49 (s,3H) ; 3.51 (d,1H) ; 3.89 (d,1H) ; 7.26 (d,2H) ; 7.59 (d,2H) ; 8.0 (s br,1H). |
| A-332 | [CDCl ₃] 1.25 (t,3H) ; 2.68 (q,2H) ; 3.36 (d,1H) ; 3.47 (s,3H) ; 3.82 (d,1H) ; 3.88 (s,3H) ; 7.25 (d,2H) ; 7.58 (d,2H). |
| A-334 | [CDCl ₃] 3.39 (d,1H) ; 3.61 (s,3H) ; 3.91 (d,1H) ; 7.36 (d,1H) ; 7.51 (d,1H). |

| | |
|-------|---|
| A-335 | [CDCl ₃] 3.35 (d,1H) ; 3.56 (s,3H) ; 3.82 (d,1H) ; 3.91 (s,3H) ; 7.34 (d,1H) ; 7.50 (d,1H). |
|-------|---|

B. 調配實例

1. 塵粉劑

塵粉劑之製法為混合 10 份重量比之式(I)化合物及 90 份重量比之滑石(作為惰性物質)，並於錘磨機中研磨混合物。

2. 分散性粉劑

容易分散在水中之可濕性粉劑之製法為混合 25 份重量比之式(I)化合物、64 份重量比之含高嶺土之石英(作為惰性物質)、10 份重量比之木質素磺酸鉀及 1 份重量比油醯基甲基牛磺酸鈉(作為濕化劑與分散劑)，並於棒式圓盤磨粉機(pinned-disk mill)中研磨混合物。

3. 分散性濃縮劑

容易分散在水中之分散性濃縮劑之製法為混合 20 份重量比之式(I)化合物與 6 份重量比之烷基酚聚二醇醚(®Triton X 207)、3 份重量比之異十三烷醇聚二醇醚(8 EO)及 71 份重量比之石蠟礦物油(沸點範圍為例如：約 255 至 277°C 以上)，並於碗磨機中研磨混合物至低於 5 微米之細度。

4. 可乳化濃縮劑

可乳化濃縮劑係由 15 份重量比之式(I)化合物、75 份重量比之環己酮(作為溶劑)及 10 份重量比之乙氧基化壬基酚(作為乳化劑)製得。

5. 水分散性粒劑

水分散性粒劑之製法為混合

75 份重量比之式(I)化合物，

10 份重量比之木質素磺酸鈣，

5 份重量比之月桂基硫酸鈉，

3 份重量比之聚乙烷基醇，及

7 份重量比之高嶺土，

於棒式圓盤磨粉機中研磨混合物，粉末於流化床上使用水(作為製粒液體)噴灑製成粒劑。

水分散性粒劑之製法亦可於膠體研磨機中均質化及預先研磨：

25 份重量比之式(I)化合物，

5 份重量比之 2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸鈉，

2 份重量比之油醯基甲基牛磺酸鈉，

1 份重量比之聚乙烷基醇，

17 份重量比之碳酸鈣，及

50 份重量比之水，

隨後於珠磨機中研磨混合物，所得懸浮液於噴霧塔中，利用單相物質噴嘴進行噴霧乾燥。

C. 生物實例

1. 對抗有害植物之出土前除草效應

取單子葉與雙子葉有害植物之種子或分段根莖置入直徑 9 至 13 公分盆之砂質壤土中，並覆蓋土壤。然後取調配成可乳化濃縮劑或塵粉劑之除草劑，以水性分散液、懸浮液或乳液型式，依 300 至 800 升水/公頃(換算後)之施用率施用至覆蓋之土壤表面。盆栽置於保持在最佳條件之溫室內，以供植物生長。試驗植物留在溫室內最佳生長條件下 3 至 4 週後，目視評分本發明化合物之活性。例如：化合物編號 1.2-7、1.2-11、1.2-42、1.2-46、1.2-62、1.2-148、1.2-202、1.3-206、1.3-110、1.5-212、1.6-206、1.7-9、1.11-9、1.11-11、

1.11-16、1.11-21、1.11-40、1.11-41 D1、1.11-42、1.11-46 D2、1.11-147、1.11-48 D1、1.11-48 D2、1.11-53、1.11-59、1.11-60、1.11-110、1.11-119、1.11-136、1.11-137、1.11-142、1.11-150、1.11-197、1.11-199、1.11-200、1.11-201、1.11-202、1.11-210、1.11-212、1.11-229、1.14-16、1.14-212、1.18-9、1.18-16、1.18-96、1.18-212、1.20-7、1.20-19 D2、1.20-20、1.20-21、1.20-42、1.20-48 D2、1.20-55、1.20-74、1.20-200、1.20-208、1.25-206、1.29-73、1.29-212、1.32-206、1.33-212 及 2.11-212 在每公頃 320 克之施用率下分別對野稗 (*Echinochloa crus galli*)、毒麥(*Lolium multiflorum*)、繁縷(*Stellaria media*)及玄參(*Veronica persica*)展現至少 90%效力。

2. 對抗有害植物之出土後除草效應

取單子葉與雙子葉有害植物之種子置入木質纖維盆之砂質壤土中，並覆蓋土壤，置於溫室中，在良好生長條件下生長。播種 2 至 3 週後，於第三葉階段處理試驗植物。取調配成可濕性粉劑或可乳化濃縮劑型式之本發明化合物，依 600 至 800 升水/公頃(換算後)之施用率施用至植物之綠色植株表面上。試驗植物留在溫室內最佳生長條件下 3 至 4 週後，目視評分本發明化合物之活性。例如：本發明化合物編號 1.2-11、1.2-53、1.20-93、1.2-102、1.2-138、1.2-200、1.3-9、1.3-206、1.6-206、1.7-96、1.11-11、1.11-20、1.11-40、1.11-53、1.11-60、1.11-93、1.11-110、1.11-119、1.11-200、1.11-212、1.11-137、1.11-142、1.11-149、1.14-96、1.14-136、1.16-110、1.18-96、1.18-206、1.20-16、1.20-40、1.20-58、1.20-200、1.20-208、1.25-102、1.25-206、1.29-73、1.32-96、1.33-102、2.2-102、2.11-96 及 2.11-212 在每公頃 320 克之施用率下，分別對看麥娘(*Alopecurus myosuroides*)及卷莖蓼(*Polygonum convolvulus*)展現至少 90%效力。

3. 殺真菌作用

實例 1：活體內保護性試驗，蒼耳單絲殼(*Sphaerotheca fuliginea*)(小黃瓜之粉黴)

製備合適之活性成份調配物時，由活性成份與丙酮/Tween/DMSO 混合，並加水稀釋至適當濃度。

取小黃瓜植株(品種：Vert petit de Paris)種在 24°C 下之 50/50 泥炭土/火山灰基質中，在 Z11 子葉期時，使用如上述指定之活性成份調配物噴灑。對照組植物則使用沒有活性成份之水溶液處理。

24 小時後，在植物上噴灑蒼耳單絲殼之孢子懸浮液(100 000 個孢子/ml)。該等孢子係從已感染之植物上收集。接種過之植物置於 20/25°C 及相對濕度 60/70 %下。

接種 12 天後進行評估。0%意指其效力相當於對照組，而 100%意指沒有觀察到感染。

在施用率 500 ppm 下，下列化合物之效力如下：

| 實例編號 | 效力[%] | | 實例編號 | 效力[%] |
|------------|-------|--|------------|-------|
| 1.3-206 | 94 | | 1.33-102 | 100 |
| 1.5-206 | 80 | | 1.32-60 | 100 |
| 1.6-206 | 94 | | 1.32-96 | 100 |
| 1.7-9 | 98 | | 1.20-19 D2 | 100 |
| 1.7-206 | 72 | | 1.20-64 | 98 |
| 1.11-19 D1 | 100 | | 1.20-206 | 100 |
| 1.11-110 | 78 | | 1.20-212 | 100 |
| 1.11-238 | 83 | | 1.20-135 | 98 |
| 1.14-16 | 100 | | 1.25-9 | 100 |
| 1.14-206 | 98 | | 1.25-16 | 95 |
| 1.16-60 | 94 | | 1.25-60 | 100 |
| 1.16-96 | 78 | | 1.25-110 | 90 |
| 1.16-110 | 89 | | 1.25-136 | 100 |
| 1.16-136 | 78 | | 1.32-9 | 100 |
| 1.16-212 | 94 | | 1.32-16 | 100 |
| 1.18-110 | 98 | | 1.32-110 | 100 |
| 1.18-212 | 98 | | 1.32-212 | 100 |
| 1.18-206 | 95 | | 1.33-9 | 100 |

| 實例編號 | 效力[%] | | 實例編號 | 效力[%] |
|----------|-------|--|----------|-------|
| 1.33-60 | 100 | | 1.33-16 | 100 |
| 1.33-96 | 100 | | 1.33-206 | 100 |
| 1.33-212 | 100 | | | |

實例 2：活體內保護性試驗，致病疫黴(*Phytophthora infestans*) (番茄晚疫病)

製備合適之活性成份調配物時，由活性成份與丙酮/Tween/DMSO 混合，並加水稀釋至適當濃度。

取番茄植物(品種：Rentita)種在 20-25°C 下之 50/50 泥炭土/火山灰基質中，在 Z12 期時，使用如上述指定之活性成份調配物噴灑。對照組植物則使用沒有活性成份之水溶液處理。

24 小時後，在植物上噴灑致病疫黴之孢子懸浮液(20 000 個孢子/ml)。該等孢子係從已感染之植物上收集。接種過之植物置於 16-18°C 之潮濕大氣下 5 天。

感染 5 天後進行評估。0%意指其效力相當於對照組，而 100%意指沒有觀察到感染。

在施用率 500 ppm 下，下列化合物之效力如下：

| 實例編號 | 效力[%] | | 實例編號 | 效力[%] |
|------------|-------|--|------------|-------|
| 1.11-19 D1 | 100 | | 1.18-212 | 99 |
| 1.11-110 | 100 | | 1.20-19 D2 | 100 |
| 1.11-136 | 100 | | 1.20-64 | 100 |
| 1.11-238 | 99 | | 1.20-206 | 100 |
| 1.11-239 | 100 | | 1.20-212 | 95 |
| 1.11-189 | 100 | | 1.25-212 | 100 |
| 1.14-110 | 100 | | 1.33-212 | 97 |
| 1.14-206 | 100 | | 2.11-206 | 100 |
| 1.16-212 | 100 | | 2.11-212 | 98 |
| 1.18-206 | 90 | | 2.20-206 | 85 |

實例 3：活體內保護性試驗，灰黴菌(*Botrytis cinerea*)(小黃瓜之灰黴病)

製備合適之活性成份調配物時，由活性成份與丙酮/Tween/DMSO 混合，

並加水稀釋至適當濃度。

取小黃瓜植株(品種：Vert petit de Paris)種在 24°C 下之 50/50 泥炭土/火山灰基質中，在 Z11 期時，使用如上述指定之活性成份調配物噴灑。對照組植物則使用沒有活性成份之水溶液處理。

24 小時後，在植物上噴灑灰黴菌之孢子懸浮液(50 000 個孢子/ml)。該等孢子係懸浮於由 10 g/L PDB、50 g/L D-果糖、2 g/L NH₄NO₃ 及 1 g/L KH₂PO₄ 組成之營養液中。

接種過之小黃瓜置於 17°C 及相對大氣濕度 80% 下培養。

感染 4 至 5 天後進行評估。0% 意指其效力相當於對照組，而 100% 意指沒有觀察到感染。

在施用率 500 ppm 下，下列化合物之效力如下：

| 實例編號 | 效力[%] | | 實例編號 | 效力[%] |
|------------|-------|--|----------|-------|
| 1.3-110 | 98 | | 1.20-110 | 83 |
| 1.5-206 | 100 | | 1.20-135 | 100 |
| 1.6-96 | 95 | | 1.20-206 | 100 |
| 1.6-110 | 100 | | 1.20-212 | 100 |
| 1.6-206 | 100 | | 1.25-9 | 99 |
| 1.7-9 | 95 | | 1.25-16 | 100 |
| 1.7-110 | 100 | | 1.25-60 | 100 |
| 1.7-206 | 99 | | 1.25-110 | 98 |
| 1.11-19 D1 | 100 | | 1.25-136 | 79 |
| 1.11-110 | 90 | | 1.25-206 | 100 |
| 1.11-238 | 100 | | 1.25-212 | 97 |
| 1.11-239 | 98 | | 1.32-9 | 100 |
| 1.14-16 | 99 | | 1.32-16 | 100 |
| 1.14-110 | 100 | | 1.32-60 | 100 |
| 1.14-136 | 88 | | 1.32-94 | 95 |
| 1.14-206 | 100 | | 1.32-110 | 100 |
| 1.16-60 | 100 | | 1.32-102 | 100 |
| 1.16-94 | 75 | | 1.32-206 | 96 |
| 1.16-96 | 85 | | 1.32-212 | 100 |
| 1.16-110 | 100 | | 1.33-9 | 89 |
| 1.16-136 | 96 | | 1.33-16 | 100 |

| 實例編號 | 效力[%] | | 實例編號 | 效力[%] |
|------------|-------|--|----------|-------|
| 1.16-212 | 100 | | 1.33-60 | 100 |
| 1.18-110 | 91 | | 1.33-96 | 100 |
| 1.18-206 | 100 | | 1.33-110 | 81 |
| 1.18-212 | 100 | | 1.33-206 | 100 |
| 1.20-19 D2 | 100 | | 1.33-212 | 100 |
| 1.20-64 | 70 | | | |

實例 4：活體內保護性試驗，小麥殼針孢(*Septoria tritici*)(小麥穎枯病)

製備合適之活性成份調配物時，由活性成份與丙酮/Tween/DMSO 混合，並加水稀釋至適當濃度。

取小麥植株(品種: Scipion)種在 22°C (12 h) / 20°C (12 h) 下之 50/50 泥炭土/火山灰基質中，在 1-葉期(高度 10 公分)時，使用如上述指定之活性成份調配物噴灑。對照組植物則使用沒有活性成份之水溶液處理。

24 小時後，在植物上噴灑以冷凍乾燥態保存之小麥殼針孢之孢子(500 000 個孢子/ml)。接種過之植物置於 18°C 及相對濕度 100% 下 72 小時，然後再於相對大氣濕度 90% 下 21 至 28 天。

接種 21 至 28 天後，與對照組植物比較進行評估。0% 意指其效力相當於對照組，而 100% 意指沒有觀察到感染。

在施用率 500 ppm 下，下列化合物之效力如下：

| 實例編號 | 效力[%] | | 實例編號 | 效力[%] |
|------------|-------|--|----------|-------|
| 1.3-206 | 100 | | 2.11-206 | 83 |
| 1.3-110 | 98 | | 2.11-212 | 83 |
| 1.5-206 | 100 | | 2.20-206 | 100 |
| 1.6-96 | 75 | | 1.25-206 | 100 |
| 1.6-110 | 100 | | 1.25-60 | 100 |
| 1.6-206 | 100 | | 1.25-212 | 100 |
| 1.7-9 | 100 | | 1.25-9 | 100 |
| 1.7-110 | 100 | | 1.25-16 | 97 |
| 1.7-206 | 100 | | 1.25-110 | 97 |
| 1.11-19 D1 | 100 | | 1.32-1 | 98 |
| 1.11-110 | 100 | | 1.32-9 | 100 |
| 1.11-136 | 100 | | 1.32-16 | 100 |

| 實例編號 | 效力[%] | | 實例編號 | 效力[%] |
|------------|-------|--|----------|-------|
| 1.11-238 | 100 | | 1.32-60 | 100 |
| 1.11-239 | 100 | | 1.32-94 | 100 |
| 1.14-16 | 100 | | 1.32-96 | 100 |
| 1.14-110 | 100 | | 1.32-102 | 100 |
| 1.14-206 | 100 | | 1.32-110 | 100 |
| 1.16-60 | 100 | | 1.32-206 | 100 |
| 1.16-96 | 88 | | 1.32-212 | 100 |
| 1.16-110 | 100 | | 1.33-1 | 100 |
| 1.16-212 | 100 | | 1.33-9 | 100 |
| 1.18-110 | 100 | | 1.33-16 | 100 |
| 1.18-212 | 100 | | 1.33-60 | 100 |
| 1.20-19 D2 | 100 | | 1.33-94 | 100 |
| 1.20-64 | 100 | | 1.33-96 | 100 |
| 1.20-110 | 100 | | 1.33-102 | 100 |
| 1.20-135 | 100 | | 1.33-110 | 100 |
| 1.20-206 | 83 | | 1.33-206 | 100 |
| 1.20-212 | 100 | | 1.33-212 | 100 |

實例 5：黑星病菌(*Venturia*)試驗(蘋果)/保護性

溶劑： 24.5 份重量比之丙酮

24.5 份重量比之二甲基乙醯胺

乳化劑： 1 份重量比之烷基芳基聚二醇醚

製備合適之活性成份調配物時，由 1 份重量比之活性成份與指定量之溶劑及乳化劑混合，並加水稀釋該濃縮劑至所需濃度。

測試保護性活性時，使用活性成份調配物，依指示之施用率噴灑植物幼苗。待噴灑層乾燥後，在植物上接種蘋果黑星病之病原菌(*Venturia inaequalis*)之水性分生孢子懸浮液，然後留在約 20 °C 與相對大氣濕度 100%之培養箱中 1 天。

植物隨後置入約 21 °C 與相對大氣濕度約 90%之溫室中。

在接種後 10 天分析。%表示其效力相當於未處理之對照組，而 100%之效力表示沒有觀察到感染。

本試驗中，下列本發明化合物在活性成份濃度 100 ppm 下展現 70%或更高之效力：

| 實例編號 | 效力[%] |
|----------|-------|
| 1.11-212 | 100 |
| 1.20-5 | 96 |
| 1.25-206 | 90 |
| 1.25-212 | 98 |

實例 6：單軸黴(*Plasmopara*)試驗(葡萄) / 保護性

溶劑： 24.5 份重量比之丙酮

24.5 份重量比之二甲基乙醯胺

乳化劑： 1 份重量比之烷基芳基聚二醇醚

製備合適之活性成份調配物時，由 1 份重量比之活性成份與指定量之溶劑及乳化劑混合，並加水稀釋該濃縮劑至所需濃度。

測試保護性活性時，使用活性成份調配物，依指示之施用率噴灑植物幼苗。待噴灑層乾燥後，在植物上接種葡萄單軸黴(*Plasmopara viticola*)之水性孢子懸浮液，然後留在約 20 °C 與相對大氣濕度 100%之培養箱中 1 天。植物隨後置入約 21 °C 與相對大氣濕度約 90%之溫室中 4 天。植物保持濕潤，並再置入培養箱中 1 天。

在接種後 6 天分析。%表示其效力相當於未處理之對照組，而 100%之效力表示沒有觀察到感染。

本試驗中，下列本發明化合物在活性成份濃度 100 ppm 下展現 70%或更高之效力：

| 實例編號 | 效力[%] |
|----------|-------|
| 1.20-5 | 99 |
| 1.25-206 | 98 |
| 1.25-212 | 100 |

【符號說明】 無

【生物材料寄存】 無

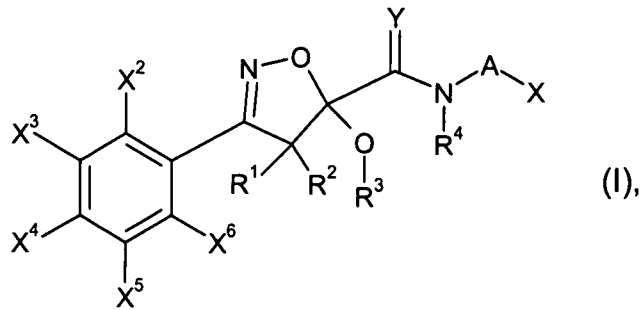
國內寄存資訊 **【請依寄存機構、日期、號碼順序註記】**

國外寄存資訊 **【請依寄存國家、機構、日期、號碼順序註記】**

【序列表】 (請換頁單獨記載) 無

申請專利範圍

1.一種式(I)之 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺或 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-硫醯胺或其鹽



其中

R^1 及 R^2 分別獨立為氫、氟、氯、溴、碘、氰基，或(C₁-C₄)-烷基或(C₁-C₄)-烷氧基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘及氰基，

或

R^1 及 R^2 與其所鍵結之碳原子共同形成由 q 個碳原子及 p 個氧原子形成之飽和或部份或完全不飽和 3-、4-或 5-員環；

R^3 為(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-環烷基、(C₂-C₆)-烯基或(C₂-C₆)-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基、(C₁-C₄)-烷氧基及羥基，

R^4 為氫、氰基，

或(C₁-C₈)-烷基、(C₃-C₈)-環烷基、(C₃-C₈)-烯基或(C₃-C₈)-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基、羥基及(C₁-C₆)-烷氧基，

A 為一個鍵結或一個選自下列所組成群中之二價單位：

個側氧基；

X^1 為由 r 個碳原子、 s 個氮原子、 n 個硫原子及 n 個氧原子形成之 3-、4-、5-或 6-員飽和、部份飽和、完全不飽和或芳香環，其係經 s 個選自下列所組成群中之基團取代： R^6 、 R^{6a} 、 R^8 及 R^9 ，其中該硫原子及碳原子帶有 n 個側氧基；

或 X^1 為經 m 個選自 R^6 、 R^{6a} 、 R^8 及 R^9 所組成群中之基團取代之苯基；

X^2 、 X^4 及 X^6 分別獨立為氫、氟、氯、溴、碘、氰基、硝基，

或(C₁-C₄)-烷基、(C₃-C₅)-環烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₂-C₄)-烯基氧、(C₂-C₄)-炔基氧或(C₁-C₄)-烷基羰基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及(C₁-C₄)-烷氧基；

X^3 及 X^5 分別獨立為氫、氟、氯、溴、碘、羥基、氰基、硝基、 SF_5 、 $CONR^8SO_2R^5$ 、 $CONR^6R^8$ 、 COR^6 、 CO_2R^8 、 $CONR^6R^8$ 、 $C(R^6)=NOR^8$ 、 NR^6COR^8 、 $NR^6CONR^8R^8$ 、 $NR^6CO_2R^8$ 、 $NR^6SO_2R^8$ 、 $NR^6SO_2NR^6R^8$ 、 $OCONR^6R^8$ 、 OSO_2R^5 、 $S(O)_nR^5$ 、 $SO_2NR^6R^8$ 、 $OSO_2NR^6R^8$ ，

或(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₅)-環烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、羥基及氰基，

或(C₁-C₆)-烷氧基、(C₃-C₆)-環烷氧基、(C₂-C₆)-烯基氧或(C₂-C₆)-炔基氧，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及(C₁-C₂)-烷氧基；

R^5 為(C₁-C₆)-烷基或(C₃-C₆)-環烷基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及羥基；

R^6 為氫或 R^5 ；

R^{6a} 為氟、氯、溴、碘、氰基、羥基、 $S(O)_nR^5$ ，或(C₁-C₆)-烷氧基、(C₃-C₆)-烯基氧或(C₃-C₆)-炔基氧，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及(C₁-C₂)-烷氧基；

R^7 為氫或(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-環烷基、(C₂-C₄)-烯基或(C₂-C₄)-炔基，其

分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、氰基及(C₁-C₂)-
 烷氧基；

R^8 為 R^7 ，

R^9 為(C₁-C₃)-烷基或(C₁-C₃)-烷氧基；

k 為 3、4、5 或 6；

m 為 0、1、2、3、4 或 5；

n 為 0、1 或 2；

p 為 0 或 1；

q 為 3、4 或 5；

r 為 1、2、3、4 或 5；

s 為 0、1、2、3 或 4。

2. 根據申請專利範圍第 1 項之 5-氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-羧醯胺或 5-
 氧-取代之 3-苯基異噁唑啉-5-硫醯胺，

其中

R^1 及 R^2 分別獨立為氫、氟、氯、溴、碘、氰基，或(C₁-C₄)-烷基或(C₁-C₄)-
 烷氧基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘
 及氰基，

或

R^1 及 R^2 與其所鍵結之碳原子共同形成由 q 個碳原子及 p 個氧原子形成之飽
 和或部份或完全不飽和 3-、4-或 5-員環；

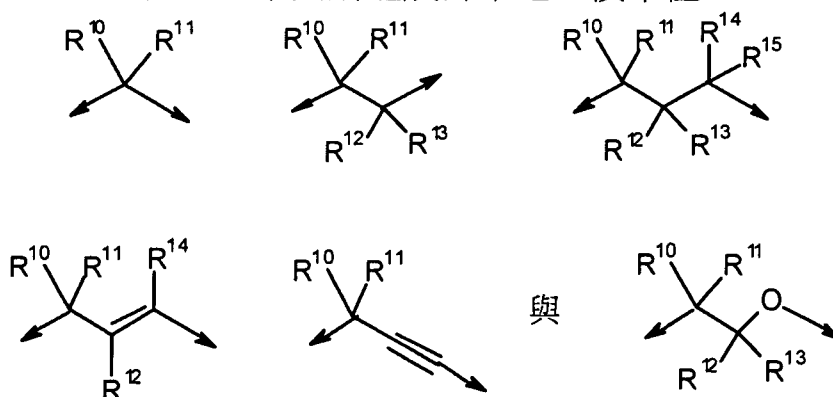
R^3 為(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-環烷基、(C₂-C₆)-烯基或(C₂-C₆)-炔基，其分別經
 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基、(C₁-C₄)-烷氧
 基及羥基，

R^4 為氫、氰基，

或(C₁-C₈)-烷基或(C₃-C₈)-環烷基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基

團取代：氟、氯、溴、碘、氰基、羥基及(C₁-C₆)-烷氧基；

A 為一個鍵結或一個選自下列所組成群中之二價單位：



R¹⁰、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴ 及 R¹⁵ 分別獨立為

氫、氟、氯、溴、碘、羥基、氰基、CO₂R⁸、CONR⁶R⁸、R⁵，

或(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₅)-環烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、羥基及氰基、

或(C₁-C₆)-烷氧基、(C₃-C₆)-環烷氧基、(C₂-C₆)-烯基氧或(C₂-C₆)-炔基氧，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及(C₁-C₂)-烷氧基；

Y 為氧或硫；

X 為氫、氰基、羥基、X¹，

或

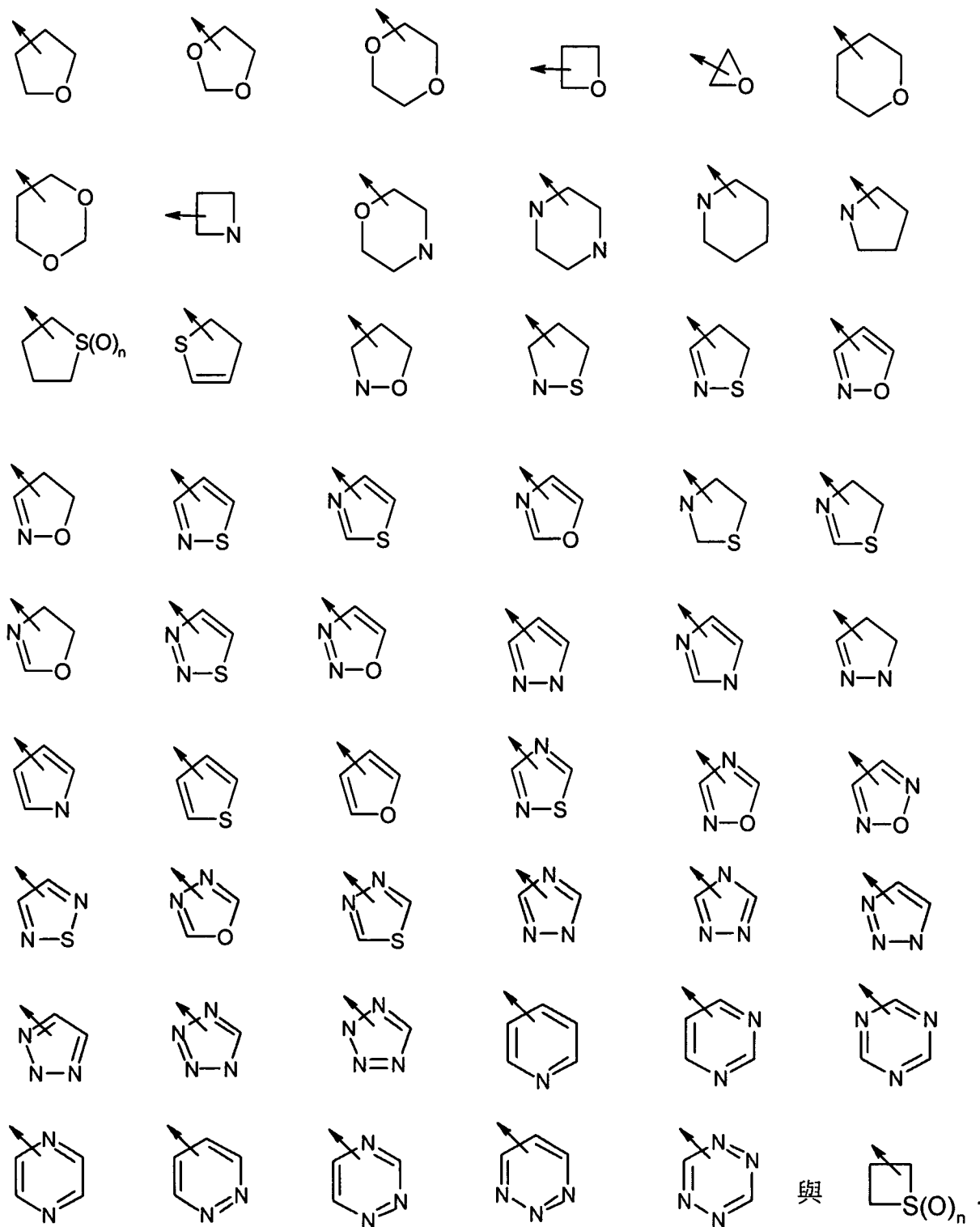
(C₁-C₁₂)-烷基、(C₃-C₈)-環烷基、(C₂-C₁₂)-烯基或(C₂-C₁₂)-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基、羥基、OR⁷、X¹、OX¹、NHX¹、S(O)_nR⁵、SO₂NR⁶R⁷、SO₂NR⁶COR⁸、CO₂R⁸、CONR⁶R⁸、COR⁶、CONR⁸SO₂R⁵、NR⁶R⁸、NR⁶COR⁸、NR⁶CONR⁸R⁸、NR⁶CO₂R⁸、NR⁶SO₂R⁸、NR⁶SO₂NR⁶R⁸、OCONR⁶R⁸、OCSNR⁶R⁸、POR⁹R⁹ 及 C(R⁶)=NOR⁸，

或

X、A 及 R⁴ 與其所鍵結之氮原子共同形成飽和或部份或完全不飽和 5-、6-

或 7-員環，其包含此氮原子及 k 個碳原子、 n 個氧原子、 p 個硫原子及 p 個選自 NR^7 及 NCOR^7 所組成群中之元素作為環原子，其中一個碳原子帶有 p 個側氧基；

X^1 為一個環，其係經 s 個選自 R^6 、 R^{6a} 、 R^8 及 R^9 所組成群中之基團取代，且係選自下列所組成群中：



或 X^1 為經 m 個選自 R^6 、 R^{6a} 、 R^8 及 R^9 所組成群中之基團取代之苯基；

X^2 、 X^4 及 X^6 分別獨立為氫、氟、氯、溴、碘、氰基、硝基，

或(C₁-C₄)-烷基、(C₃-C₅)-環烷基、(C₂-C₄)-烯基、(C₂-C₄)-炔基、(C₁-C₄)-烷氧基、(C₂-C₄)-烯基氧、(C₂-C₄)-炔基氧或(C₁-C₄)-烷基羰基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及(C₁-C₄)-烷氧基；

X^3 及 X^5 分別獨立為氫、氟、氯、溴、碘、羥基、氰基、硝基、 SF_5 、 $CONR^8SO_2R^5$ 、 $CONR^6R^8$ 、 COR^6 、 CO_2R^8 、 $CONR^6R^8$ 、 $C(R^6)=NOR^8$ 、 NR^6COR^8 、 $NR^6CONR^8R^8$ 、 $NR^6CO_2R^8$ 、 $NR^6SO_2R^8$ 、 $NR^6SO_2NR^6R^8$ 、 $OCOR^6R^8$ 、 OSO_2R^5 、 $S(O)_nR^5$ 、 $SO_2NR^6R^8$ 、 $OSO_2NR^6R^8$ ，

或(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₅)-環烷基、(C₂-C₆)-烯基、(C₂-C₆)-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、羥基及氰基，

或(C₁-C₆)-烷氧基、(C₃-C₆)-環烷氧基、(C₂-C₆)-烯基氧或(C₂-C₆)-炔基氧，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及(C₁-C₂)-烷氧基；

R^5 為(C₁-C₆)-烷基或(C₃-C₆)-環烷基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及羥基；

R^6 為氫或 R^5 ；

R^{6a} 為氟、氯、溴、碘、氰基、羥基、 $S(O)_nR^5$ ，或(C₁-C₆)-烷氧基、(C₂-C₆)-烯基氧或(C₂-C₆)-炔基氧，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及(C₁-C₂)-烷氧基；

R^7 為氫或(C₁-C₆)-烷基、(C₃-C₆)-環烷基、(C₂-C₄)-烯基或(C₂-C₄)-炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、碘、氰基及(C₁-C₂)-烷氧基；

R^8 為 R^7 ，

R^9 為(C₁-C₃)-烷基或(C₁-C₃)-烷氧基；

k 為 3、4、5 或 6；

m 為 0、1、2、3、4 或 5；

n 為 0、1 或 2；

p 為 0 或 1；

q 為 3、4 或 5；

s 為 0、1、2、3 或 4。

3. 根據申請專利範圍第 1 項之 5-氧-取代之 3-苯基異喹啉-5-羧醯胺或 5-氧-取代之 3-苯基異喹啉-5-硫醯胺，

其中

R^1 及 R^2 分別獨立為氫、氟、氯、溴、碘、氰基，或經 m 個選自氟、氯、溴、碘及氰基所組成群中之基團取代之 (C_1-C_4) -烷基；

R^3 為 (C_1-C_4) -烷基、 (C_3-C_4) -環烷基、 (C_2-C_3) -烯基或 (C_2-C_3) -炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、溴、氰基、 (C_1-C_2) -烷氧基，

A 為一個鍵結或一個選自下列所組成群中之二價單位： CH_2 、 CH_2CH_2 、 $CHCH_3$ 、 $CH_2CH_2CH_2$ 、 $CH(CH_2CH_3)$ 、 $CH(CH_3)CH_2$ 、 $C(CH_3)_2$ 、 $C(CH_3)_2CH_2$ 、 $C(iPr)CH_3$ 、 $CH(CH_2iPr)CH_2$ 、 $CH_2CH=CH$ 、 $C(CH_3)_2C\equiv C$ 、 $CH(CF_3)CH_2$ 、 $CH(CH_3)CH_2O$ 、 CH_2CH_2O 、 $CH(cPr)CH_2O$ 、 $CH(CH_2OCH_3)$ 、 $CH(CH_2CH_2SCH_3)$ 、 $CH(COOH)$ 、 $CH(COOCH_3)$ 、 $CH(COOH)CH_2$ 、 $CH(COOCH_3)CH_2$ 、 $CH_2COH(CF_3)$ 、 $CH(CONHCH_3)$ 、 $CH(CONHCH_3)CH_2$ 與 $CH_2CH_2CONHCH_2$ ；

R^4 為氫或 (C_1-C_8) -烷基；

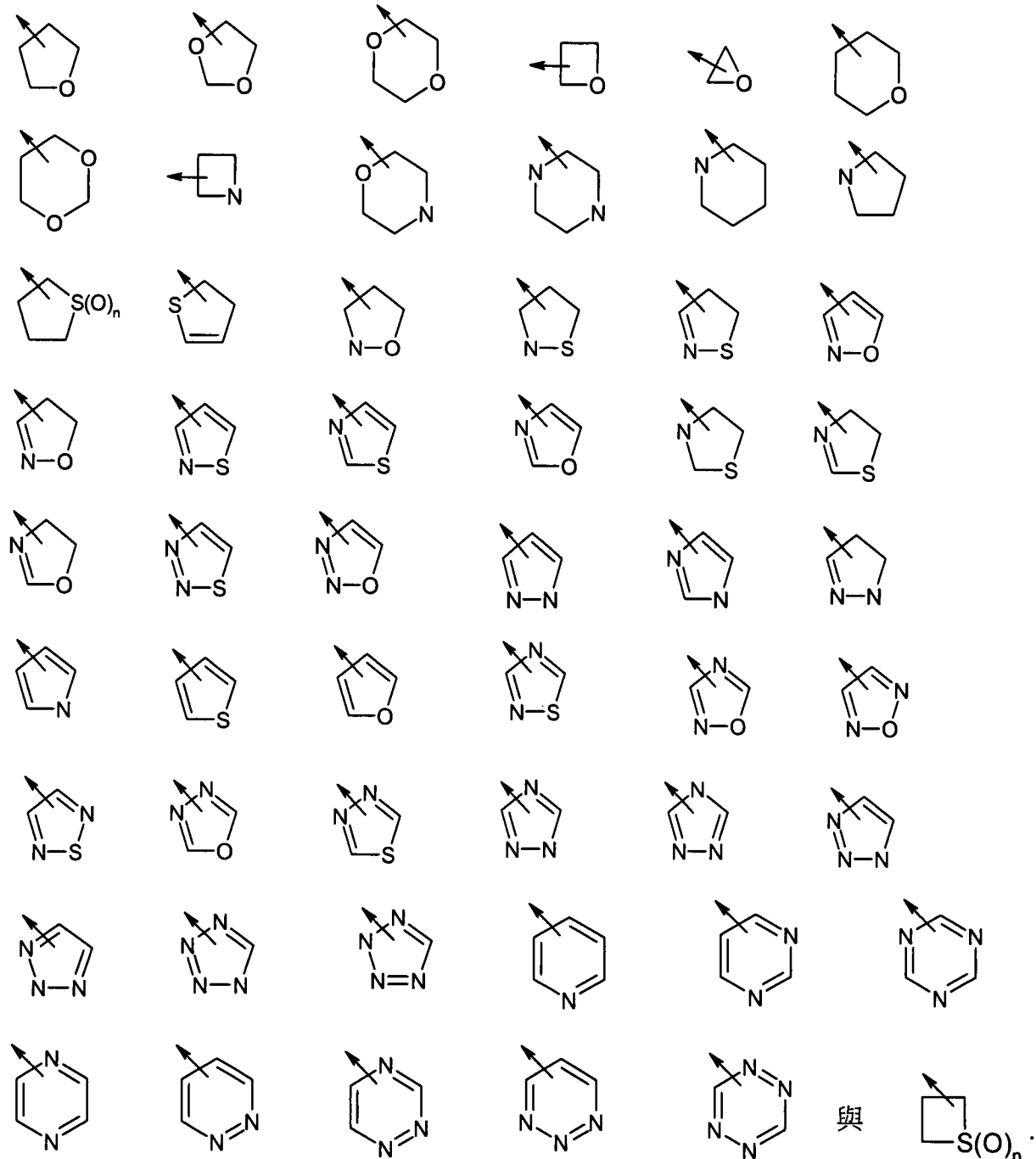
Y 為氧或硫；

X 為氫、氰基、羥基、 X^1 ，

或

(C_1-C_{12}) -烷基、 (C_3-C_8) -環烷基、 (C_2-C_{12}) -烯基或 (C_2-C_{12}) -炔基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、氰基、羥基、 OR^7 、 X^1 、 OX^1 、 NHX^1 、 $S(O)_nR^5$ 、 CO_2R^8 、 $CONR^6R^8$ 、 $CONR^8SO_2R^5$ 及 POR^9R^9 ；

X^1 為一個環，其係經 s 個選自 R^6 、 R^{6a} 、 R^8 及 R^9 所組成群中之基團取代，
且係選自下列所組成群中：



或 X^1 為經 m 個選自 R^6 、 R^{6a} 、 R^8 及 R^9 所組成群中之基團取代之苯基；

X^2 、 X^4 及 X^6 分別獨立為氫、氟、或氯，

或 (C_1-C_4) -烷基或 (C_1-C_4) -烷氧基，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：氟、氯、氰基及 (C_1-C_4) -烷氧基；

X^3 及 X^5 分別獨立為氫、氟、氯、溴、氰基，

或經 m 個選自氟及氯所組成群中之基團取代之 (C_1-C_6) -烷基，

或經 m 個選自氟及氯所組成群中之基團取代之 (C_1-C_6) -烷氧基；

R^5 為甲基或乙基；

R^6 為氫或 R^5 ；

R^{6a} 為氟、氯、溴、碘、氰基、羥基、 $S(O)_nR^5$ ，或 (C_1-C_6) -烷氧基、 (C_2-C_6) -烯基氧或 (C_2-C_6) -炔基氧，其分別經 m 個選自下列所組成群中之基團取代：

氟、氯、溴、氰基及 (C_1-C_2) -烷氧基；

R^7 為氫或經 m 個選自氟及氯所組成群中之基團取代之 (C_1-C_6) -烷基；

R^8 為 R^7 ，

R^9 為 (C_1-C_3) -烷氧基；

m 為 0、1、2 或 3；

n 為 0、1 或 2；

s 為 0、1、2、3 或 4。

4. 一種除草組成物，其特徵在於包含除草活性量之至少一種根據申請專利範圍第 1 項之式(I)化合物。

5. 根據申請專利範圍第 4 項之除草組成物，其係與調配輔劑混合。

6. 根據申請專利範圍第 4 項之除草組成物，其包含至少另一種選自下列所組成群中之農藥活性物質：殺昆蟲劑、殺蟬蟎劑、除草劑、殺真菌劑、安全劑及生長調節劑。

7. 根據申請專利範圍第 4 項之除草組成物，其包含安全劑。

8. 根據申請專利範圍第 7 項之除草組成物，其中該安全劑係選自下列所組成群中：吡唑解草酯(mefenpyr-diethyl)、環丙磺醯胺(cyprosulfamide)、雙苯

噁唑酸(isoxadifen-ethyl)、毒嗒(cloquintocet-mexyl)、解草酮(benoxacor)及二氯丙烯胺(dichlormid)。

9. 根據申請專利範圍第 4 項之除草組成物，其另外包含其他除草劑。

10. 一種控制不要之植物之方法，其包括施用有效量之至少一種根據申請專利範圍第 1 項之式(I)化合物或根據申請專利範圍第 4 項之除草組成物至植物或有不要之植物生長之地區。

11. 一種根據申請專利範圍第 1 項之式(I)化合物或根據申請專利範圍第 4 項之除草組成物的用途，係用於控制不要之植物。

12. 根據申請專利範圍第 10 項之用途，其中使用式(I)化合物控制有用作物中不要之植物。

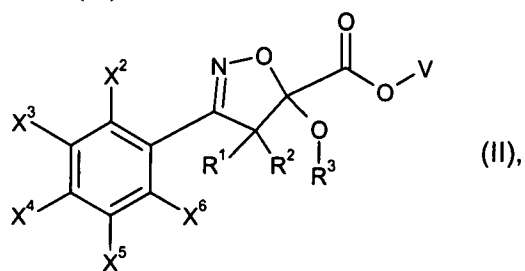
13. 根據申請專利範圍第 12 項之用途，其中該有用植物為轉殖基因之有用植物。

14. 一種殺真菌組成物，其特徵在於殺真菌性活性量之至少一種根據申請專利範圍第 1 項之式(I)化合物。

15. 根據申請專利範圍第 14 項之殺真菌組成物，其係與調配輔劑混合。

16. 根據申請專利範圍第 14 項之殺真菌組成物，其包含至少另一種選自下列所組成群中之農藥活性化合物：殺昆蟲劑、殺蟎劑、除草劑、殺真菌劑、安全劑及生長調節劑。

17. 一種式(II)化合物



其中

V 為氫或 R⁵，及

X¹、X²、X³、X⁴、X⁵、X⁶、R¹、R²、R³及 R⁵分別如申請專利範圍第 1 項之定義。