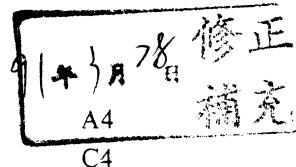


公告本

申請日期	87. 8. 4
案 號	87112794
類 別	C07C 307/00, A01N 41/06



491832

(以上各欄由本局填註)

發明專利說明書

一、發明 名稱	中 文	殺微生物之 N-磺醯基甘氨酸炔基氧基苯乙基醯胺衍生物
	英 文	MICROBICIDAL N-SULFONYLGLYCIN ALKYNYOXYPHENETHYL AMIDE DERIVATIVES
二、發明人 創作	姓 名	1.馬丁.蔡勒 2.安德瑞.尙古納特
	國 籍	瑞 士
	住、居所	1.瑞士 5400 巴登,克濃尼巷 7 號 2.瑞士 4054 巴賽爾,比爾西吉街 81 號
三、申請人	姓 名 (名稱)	諾華公司
	國 籍	瑞 士
	住、居所 (事務所)	瑞士 4058 巴賽爾城,黑森林大道 20015 號
	代 表 人 姓 名	1.威納.瓦得克 2.瓦特勞.佛格勒

裝

訂

線

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大 類：
I P C 分類：

A6
B6

本案已向：

瑞士 國 (地區) 申請專利，申請日期：1997.8.6 案號：1864/97，☒有 ☐無主張優先權

1864/97

有關微生物已寄存於：，寄存日期：，寄存號碼：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

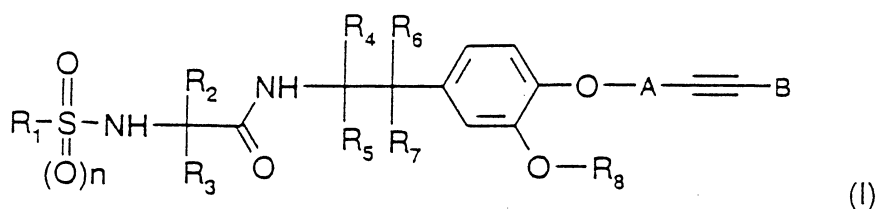
裝 訂 線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (1)

本發明係關於下式 I 之新穎 α - 胺基酸衍生物。本發明相關於這些物質的製備且相關於包括至少一種這些化合物作為活性成分之農業化學組成物。本發明亦關於該組成物的製備且相關於該化合物或該組成物於控制或預防植物被植物病原性微生物，特別是真菌感染之用途。

本發明關於通式 I 之化合物



及其可能之異構物及其異構物之混合物，

其中

n 為數字 0 或 1；且

R_1 為 $C_1 - C_{12}$ 烷基，其為未取代的或可經 $C_1 - C_4$ 烷氧基， $C_1 - C_4$ 烷基硫基， $C_1 - C_4$ 烷基磺基， $C_3 - C_8$ 環烷基，氰基， $C_1 - C_6$ 烷氧基羰基， $C_3 - C_6$ 烯基氧基羰基所取代或經由 $C_3 - C_6$ 炔基氧基羰基所取代； $C_3 - C_8$ 環烷基； $C_2 - C_{12}$ 烯基； $C_2 - C_{12}$ 炔基； $C_1 - C_{12}$ 鹵烷基；或 $NR_{11}R_{12}$ 基團，其中 R_{11} 及 R_{12} 為各自獨立為氫或 $C_1 - C_6$ 烷基，或一起為丁撐或戊撐；

R_2 及 R_3 各自獨立為氫； $C_1 - C_8$ 烷基；經基， $C_1 - C_4$ 烷氧基，氫硫基取代或經由 $C_1 - C_4$ 烷基硫基取代之 $C_1 - C_8$ 烷基； $C_3 - C_8$ 烯基； $C_3 - C_8$ 炔基； $C_3 - C_8$ 環烷基； $C_3 - C_8$ 環烷基 - $C_1 - C_4$ 烷基；或兩個 R_2

五、發明說明 (>)

及 R_3 基團與它們所結合之碳原子共同形成三至八員之碳環；

R_4 ， R_5 ， R_6 及 R_7 為相同的或相異的且個別獨立為氫或 $C_1 - C_4$ 烷基；

R_8 為 $C_1 - C_6$ 烷基， $C_3 - C_6$ 烯基或 $C_3 - C_6$ 炔基；

A 為 $C_1 - C_6$ 烷撐；且

B 為可選擇地單一或多一核，未取代的或經取代的芳基；可選擇地單一或多一核，未取代的或經取代的雜芳基； $C_4 - C_{12}$ 烷基；或 $C_3 - C_8$ 環烷基。

在前述意義中之芳基的實施例為：

苯基，萘基，蒽基，菲基。

雜芳基的實施例為：

呋喃基，噻吩基，吡咯基，咪唑基，吡唑基，噻唑基，異噻唑基，噁唑基，異噁唑基，噁二唑基，噻二唑基，三唑基，四唑基，吡啶基，嗒吡基，嘧啶基，吡嗪基，三嗪基，四嗪基，吡啶基，苯並噻吩基，苯並呋喃基，苯並咪唑基，吡啶基，苯並三唑基，苯並噻唑基，苯並噁唑基，喹啉基，異喹啉基，吡嗪基，喹啉基，喹啉基，噻吩基，噻吩基，噻吩基。

那些芳基或雜芳基基團之取代基之實施例為：

烷基，烯基，炔基，環烷基，環烷基-烷基，苯基，苯基-烷基，其可能為那些基團攜帶一或多個相同或不同

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明(3)

的鹵原子；烷氧基，烯氧基；炔氧基；烷氧基烷基；鹵烷氧基；烷基硫基；鹵烷基硫基；烷基磺醯基；甲醯基；烷醯基；羥基；鹵素；氰基；硝基；胺基；烷基胺基；二烷基胺基；羧基；烷氧基羰基；烯氧基羰基；炔氧基羰基。

在上述式 I 中，“鹵素”包括氟，氯，溴及碘。

該烷基，烯基及炔基可為直鏈或分枝，且此亦應用於其他包含烷基－，烯基－或炔基基團之烷基，烯基或炔基部份。

視所提到之碳原子的數目而定，在其自己所有或作為其他取代基之部分之烷基被了解的可為，例如，甲基，乙基，丙基，丁基，戊基，己基，庚基，辛基，壬基，癸基，十一基，十二基及其異構物，例如，異丙基，異丁基，第三丁基或第二丁基，異戊基或第三戊基。環烷基為，視所提到之碳原子的數目而定，可為環丙基，環丁基，環戊基，環己基，環庚基或環辛基。

視所提到之碳原子的數目而定，烯基作為基團或為其他基團之結構單元被了解的可為，乙烯基，烯丙基，丁烯－2－基，丁烯－3－基，戊烯－1－基，戊烯－3－基，己烯－1－基，4－甲基－3－戊烯基或4－甲基－3－己烯基。

炔基作為基團或為其他基團之結構單元為，例如，乙炔基，丙炔－1－基，丙炔－2－基，丁炔－1－基，丁炔－2－基，1－甲基－2－丁炔基，己炔－1－基，1－乙基－2－丁炔基，辛炔－1－基。

五、發明說明(4)

鹵烷基可具有一個或多個(相同或不同的)鹵原子，例如， CHCl_2 ， CH_2F ， CCl_3 ， CH_2Cl ， CHF_2 ， CF_3 ， $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Br}$ ， C_2Cl_5 ， CH_2Br ， CHClBr ， CF_3CH_2 等。

在式 I 化合物中之存在至少一個不對稱碳原子及／或至少一個不對稱硫原子的意思為該化合物可以光學異構物形式產生。因此一可能之脂肪族 $\text{C}=\text{C}$ 雙鍵之存在，幾何異構物亦可產生。式 I 為意欲包括所有那些可能的異構物形式及其混合物。

所定之式 I 化合物之偏好為其中

R_1 為 C_1-C_{12} 烷基， C_3-C_8 環烷基； C_2-C_{12} 烯基； C_2-C_{12} 炔基； C_1-C_{12} 鹵烷基；或 $\text{NR}_{11}\text{R}_{12}$ 基團，其中 R_{11} 及 R_{12} 為各自獨立為氫或 C_1-C_6 烷基，或一起為丁撐或戊撐；

R_2 及為氫；

R_3 為 C_1-C_8 烷基；經基， C_1-C_4 烷氧基，氫硫基取代或經由 C_1-C_4 烷基硫基取代之 C_1-C_8 烷基； C_3-C_8 烯基； C_3-C_8 炔基； C_3-C_8 環烷基；或 C_3-C_8 環烷基- C_1-C_4 烷基；

B 為苯基；萘基；或自一個或兩個五-或六-員環及可包含選擇自氮，氧及硫之自 1 至 4 相同或不同的雜原子所形成之雜芳基；其中該苯基，萘基或雜芳基可選擇地攜帶自 1 至 5 個相同或相異的取代基，該取代基係選擇自 C_1-C_8 烷基， C_2-C_8 烯基， C_2-C_8 炔基， C_3-C_8 環

五、發明說明 (5)

烷基， $C_3 - C_8$ 環烷基， $C_1 - C_4$ 烷基，苯基，苯基- $C_1 - C_4$ 烷基，那些基團為未取代的或單一至全一鹵化且該鹵素原子可為相同或相異； $C_1 - C_8$ 烷氧基； $C_3 - C_8$ 烯氧基； $C_3 - C_8$ 炔氧基； $C_1 - C_4$ 烷氧基- $C_1 - C_4$ 烷基； $C_1 - C_8$ 鹵烷氧基； $C_1 - C_8$ 烷基硫基； $C_1 - C_8$ 鹵烷基硫基； $C_1 - C_8$ 烷基磺基；甲磺基； $C_2 - C_8$ 烷磺基；羥基；鹵素；氰基；硝基；胺基； $C_1 - C_8$ 烷基胺基； $C_1 - C_8$ 二烷基胺基；羧基； $C_1 - C_8$ 烷氧基羰基； $C_3 - C_8$ 烯氧基羰基；及 $C_3 - C_8$ 炔氧基羰基（亞群A）。

在亞群A的範疇中，特別提及的應為由那些式I之化合物所製成，其中

R_1 為 $C_1 - C_6$ 烷基； $C_5 - C_6$ 環烷基； $C_2 - C_6$ 烯基； $C_1 - C_6$ 鹵烷基；或 $NR_{11}R_{12}$ 基團，其中 R_{11} 及 R_{12} 為各自獨立為氫或 $C_1 - C_6$ 烷基；

R_3 為 $C_1 - C_8$ 烷基；或 $C_3 - C_6$ 環烷基；

R_4 為氫或 $C_1 - C_4$ 烷基；

R_5 ， R_6 及 R_7 為氫；

R_8 為 $C_1 - C_6$ 烷基；

A為 $C_1 - C_2$ 烷撐；且

B為苯基，萘基，呋喃基，噻吩基，吡咯基，咪唑基，吡唑基，噻唑基，噁唑基，吡啶基，嘧啶基，吡嗪基，三嗪基，吲哚基，苯並硫基苯基，苯並呋喃基，苯並咪唑基，苯並噻唑基或苯並噁唑基，每一個為未取代的或經由自1至5個取代基所取代，該取代基係選擇自：

五、發明說明(6)

$C_1 - C_8$ 烷基， $C_2 - C_8$ 烯基， $C_2 - C_8$ 炔基， $C_3 - C_8$ 環烷基， $C_3 - C_8$ 環烷基- $C_1 - C_4$ 烷基，苯基，苯基- $C_1 - C_4$ 烷基，那些基團為未取代的或單一至全一鹵化且該鹵素原子可為相同或相異； $C_1 - C_8$ 烷氧基； $C_3 - C_8$ 烯氧基； $C_3 - C_8$ 炔氧基； $C_1 - C_4$ 烷氧基- $C_1 - C_4$ 烷基； $C_1 - C_8$ 鹵烷氧基； $C_1 - C_8$ 烷基硫基； $C_1 - C_8$ 鹵烷基硫基； $C_1 - C_8$ 烷基磺基；甲磺基； $C_2 - C_8$ 烷磺基；羥基；鹵素；氰基；硝基；胺基； $C_1 - C_8$ 烷基胺基； $C_1 - C_8$ 二烷基胺基；羧基； $C_1 - C_8$ 烷氧基羰基； $C_3 - C_8$ 烯氧基羰基；及 $C_3 - C_8$ 炔氧基羰基（亞群 B）。

在亞群 B 的範疇中，所給定之特別較佳為式 I 之化合物之基團，其中

n 為數字 1；

R_1 為 $C_1 - C_6$ 烷基； $C_1 - C_6$ 鹵烷基；或 $NR_{11}R_{12}$ 基團，其中 R_{11} 及 R_{12} 為各自獨立為 $C_1 - C_4$ 烷基；

R_3 為 $C_3 - C_4$ 烷基；或環丙基；

R_4 為氫或甲基；

R_8 為 $C_1 - C_2$ 烷基；

A 為甲撐；且

B 為苯基，萘基，呋喃基，噻吩基，吡啶基，嘧啶基，三吡基，苯並硫基苯基，每一個為未取代的或經由自 1 至 3 個取代基所取代，該取代基係選擇自： $C_1 - C_8$ 烷基，苯基，那些基團為未取代的或單一至全一鹵化且該鹵素原子可為相同或相異； $C_1 - C_8$ 烷氧基； $C_3 - C_8$ 烯氧基

五、發明說明(7)

； $C_3 - C_8$ 炔氧基； $C_1 - C_8$ 鹵烷基氧基； $C_1 - C_8$ 烷基硫基； $C_1 - C_8$ 鹵烷基硫基； $C_1 - C_8$ 烷基磺醯基；甲醯基； $C_2 - C_8$ 烷醯基；羥基；鹵素；氰基；硝基；及 $C_1 - C_8$ 烷氧基羰基（亞群 C_a ）。

在亞群 C_a 的範疇中之特別基團包括式 I 之化合物，其中

R_1 為 $C_1 - C_4$ 烷基；或二甲基胺基；

R_3 為 2-丙基；

R_8 為甲基；

B 為苯基，萘基，每一個為未取代的或經由自 1 至 3 個取代基所取代，該取代基係選擇自： $C_1 - C_8$ 烷基， $C_1 - C_8$ 鹵烷基， $C_1 - C_8$ 烷氧基； $C_1 - C_8$ 鹵烷氧基； $C_1 - C_8$ 烷基硫基； $C_1 - C_8$ 鹵烷基硫基；鹵素；氰基；硝基；及 $C_1 - C_8$ 烷氧基羰基（亞群 C_b ）。

在亞群 C_a 的範疇中之另外特別較佳基團包括式 I 之化合物，其中

R_1 為 $C_1 - C_4$ 烷基；或二甲基胺基；

R_3 為 2-丙基；

R_8 為甲基；

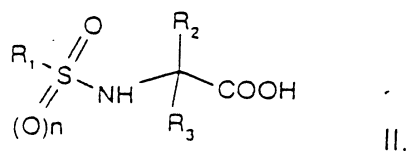
B 為噻吩基，吡啶基，每一個為未取代的或經由自 1 至 3 個取代基所取代，該取代基係選擇自： $C_1 - C_8$ 烷基， $C_1 - C_8$ 鹵烷基， $C_1 - C_8$ 烷氧基； $C_1 - C_8$ 鹵烷氧基； $C_1 - C_8$ 烷基硫基； $C_1 - C_8$ 鹵烷基硫基；鹵素；氰基；硝基（亞群 C_c ）。

五、發明說明(8)

特定之具有不同種類的結構之 α - 胺基酸衍生物已經被建議為可控制有害植物之真菌（例如，於 EP - 3 9 8 0 7 2，EP - 4 2 5 9 2 5，DE - 4 0 2 6 9 6，EP - 4 7 7 6 3 9，EP - 4 9 3 6 8 3，DE - 4 0 3 5 8 5 1，EP - 4 8 7 1 5 4，EP - 4 9 6 2 3 9，EP - 5 5 0 7 8 8 及 EP - 5 5 4 7 2 9）。然而，那些製劑之作用並不被滿意。令人驚訝地，具有式 I 之化合物結構，新種類之殺微生物劑已被發現具有高度活性。

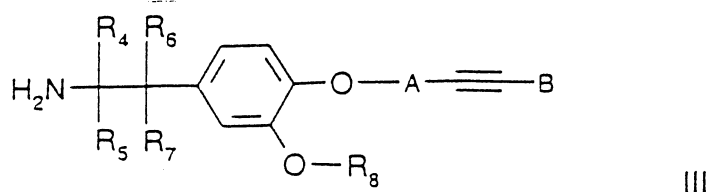
該式 I 化合物可如下所述被製備：

a) 經由將式 I I 之經取代的胺基酸



其中 R_1 ， R_2 及 R_3 基及 n 為如前述所定義，或其羧基活化衍生物，若需要，在催化劑的存在下，若需要，在酸性結合劑存在下及若需要，在稀釋劑存在下，

與式 I I I 之胺反應



其中 R_4 ， R_5 ， R_6 ， R_7 ， R_8 ，A 及 B 為如前述所

五、發明說明 (9)

定義。

所需用來進行根據本發明之方法 a) 之式 I I 之胺基酸衍生物為其本質已知。

式 I I I 之胺類為新穎的且本發明亦關於此。

式 I I I 之胺類可依照如下所述之方法 a a) 製備。

式 I I 胺基酸之適合的羧基－活化衍生物包括任何羧基活化衍生物，例如，酸性鹵化物類，例如，酸性氯化物類；對稱性或混合性酐類；例如，混合性 O－烷基羧酸酐類；及亦為活化酯類，例如，對－硝基苯基酯類或 N－羥基琥珀醯亞胺酯類，及使用縮合劑，例如，二環己基碳化二亞胺，羰基二咪唑，O－（苯並三唑－1－基）－N，N，N’，N’－雙（五亞甲基）脲酯 六氟磷酸，O－（苯並三唑－1－基）－N，N，N’，N’－雙（四亞甲基）脲酯 六氟磷酸，（苯並三唑－1－基）－三吡咯烷磷酯 六氟磷酸，（苯並三唑－1－基氧基）－三（二甲基胺基）磷酯 六氟磷酸或 O－（苯並三唑－1－基）－N，N，N’，N’－四甲基脲酯 六氟磷酸進行原位製造之活化形式胺基酸。

相當於式 I I 胺基酸之混合酐類可經由式 I I 胺基酸與氯甲酸酯類，例如，氯甲酸烷基酯類，較佳為氯甲酸異丁基酯，若需要，於酸性結合劑存在下，例如，無機鹼或有機鹼，例如，三級胺，如三乙基胺，吡啶，N－甲基哌啶或 N－甲基嗎啉，進行反應而製備。

式 I I 胺基酸，或式 I I 胺基酸之羧基－活化衍生物

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

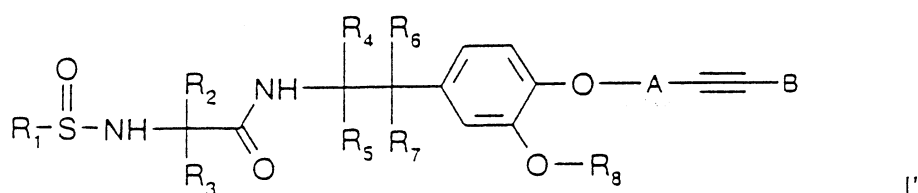
訂

線

五、發明說明(10)

類，與式 I I I 之胺類的反應係進行於惰性稀釋劑中，例如，芳香族，非芳香族或經鹵化之碳氫化合物類，例如，氯化的碳氫化合物，如二氯甲烷或甲苯；酮類，例如，丙酮；酯類，例如，乙酸乙酯；鹽胺類，例如，二甲基甲醯胺；腈類，例如，乙腈；或醚類，例如，四氫呋喃，二噁烷，二乙醚或第三丁基甲基醚；或那些惰性稀釋劑類之混合物，若需要，在酸性結合劑的存在下，例如，無機鹼或有機鹼，例如，三級胺，如三乙基胺，吡啶，N-甲基哌啶或 N-甲基嗎啉，於溫度自 -80 至 $+150^{\circ}\text{C}$ ，較佳為自 -40 至 $+40^{\circ}\text{C}$ 。

b) 經由式 I' 化合物之氧化



其中 R_1 ， R_2 ， R_3 ， R_4 ， R_5 ， R_6 ， R_7 ， R_8 ， A 及 B 如前述所定義，條件是取代基 R_1 ， R_2 ， R_3 及 B 無包含硫醇或烷基硫醇基團。

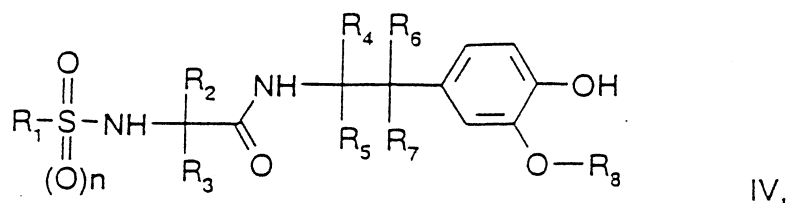
合適之氧化劑包括有機氧化劑類，例如，烷基氫過氧化物類，例如，茴香基氫過氧化物，及無機氧化劑類，例如，過氧化物類，例如，過氧化氫，及過渡金屬氧化物類，例如，三氧化鉻，及過渡金屬氧化物鹽類，例如，高錳

五、發明說明 (11)

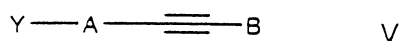
酸鉀，重鉻酸鉀或重鉻酸鈉。

式 I' 化合物與氧化劑之反應進行於惰性稀釋劑中，例如，水或酮，例如，丙酮，或於那些惰性稀釋劑之混合物中，若需要，於酸之存在下或，若需要，於鹼之存在下，自 -80 至 $+150^{\circ}\text{C}$ 之溫度中。

c) 經由將式 I V



其中 R_1 ， R_2 ， R_3 ， R_4 ， R_5 ， R_6 ， R_7 ， R_8 及 n 為如前述所定義，與式 V 之化合物



其中 A 及 B 為如前述所定義且其中 Y 為一離去基團，進行反應。

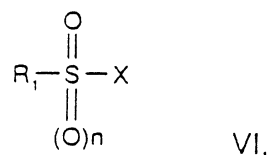
合適的離去基團包括鹵化物類，例如，氯化物類或溴化物類，及磺酸鹽類，例如，甲苯磺酸鹽類，甲磺酸鹽類或三氟磺酸甲酯類 (triflates)。

式 I V 化合物與式 V 化合物的反應係進行於惰性稀釋劑中。下列所提及的可作為實施例：芳香族，非芳香族或經鹵化之碳氫化合物類，例如，甲苯或二氯甲烷；酮類，

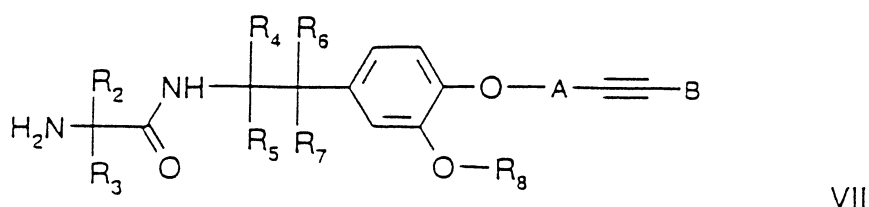
五、發明說明 (12)

例如，丙酮；酯類，例如，乙酸乙酯；醯胺類，例如，二甲基甲醯胺；腈類，例如，乙腈；醚類，例如，四氫呋喃，二噁烷，二乙醚或第三丁基甲基醚；醇類，例如，甲醇，乙醇，正丁醇，異丙醇或第三丁醇；二甲亞砷；或水；或那些惰性稀釋劑類之混合物。式 I V 化合物與式 V 化合物的反應係進行於，若需要，在酸性結合劑的存在下。合適的酸性結合劑包括無機鹼類或有機鹼類，例如，鹼金屬或鹼土金屬氫氧化物，醇鹽或碳酸鹽，例如，氫氧化鈉，氫氧化鉀，甲醇鈉，甲醇鉀，乙醇鈉，乙醇鉀，第三丁醇鈉，第三丁醇鉀，碳酸鈉或碳酸鉀。溫度為自 -80 至 $+120^{\circ}\text{C}$ ，較佳為自 0 至 $+120^{\circ}\text{C}$ 。

d) 經由將式 V I 之磺酸或亞磺酸，或磺酸或亞磺酸衍生物



其中個別地 R_1 及 n 為如前述所定義且其中 X 為 OH 基團或離去基團，與式 V I I 之胺類



其中， R_2 ， R_3 ， R_4 ， R_5 ， R_6 ， R_7 ， R_8 ， A 及

五、發明說明(13)

B 爲如前述所定義，進行反應。

本發明亦關於式 V I I 化合物及其製備。

所需用來進行方法 d) 之式 V I 之磺酸或亞磺酸，或磺酸或亞磺酸衍生物爲其本質已知。亦需要之式 V I I 之胺類爲新穎的且本發明亦關於此；它們可依照如下所述之方法 b b) 製備。

合適的式 V I 之磺酸或亞磺酸，或磺酸或亞磺酸衍生物爲包括任何其中 X 爲離去基團之化合物類，例如，磺酸鹵化物類或亞磺酸鹵化物類，例如，磺酸氯化物類或亞磺酸氯化物類；亦爲對稱性或混合酞類；且亦爲使用縮合劑類，例如，二環己基碳化二亞胺或羰基二咪唑，原位產生之活化形式的磺酸或亞磺酸。

式 V I 之磺酸或亞磺酸，或磺酸或亞磺酸衍生物與式 V I I 之胺類的反應係進行於惰性稀釋劑中，例如，芳香族，非芳香族或經鹵化之碳氫化合物類，例如，氯化之碳氫化合物，如二氯甲烷或甲苯；酮類，例如，丙酮；酯類，例如，乙酸乙酯；醯胺類，例如，二甲基甲醯胺；腈類，例如，乙腈；醚類，例如，四氫呋喃，二噁烷，二乙醚或第三丁基甲基醚；或水；或那些惰性稀釋劑類之混合物，若需要，在酸性結合劑的存在下，例如，無機鹼類或有機鹼類，例如，鹼金屬或鹼土金屬氫氧化物或碳酸鹽，或，例如，三級胺，例如，三乙胺，吡啶，N - 甲基哌啶或 N - 甲基嗎啉，溫度爲自 - 8 0 至 + 1 5 0 °C，較佳爲自 - 2 0 至 + 6 0 °C。

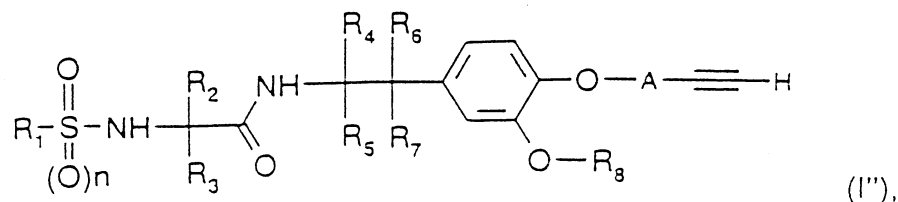
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (15)

e) 經由將式 I'' 之炔類



其中 R_1 , R_2 , R_3 , R_4 , R_5 , R_6 , R_7 , R_8 , A 及 n 為前述所定義，與一芳基鹵化物或雜芳基鹵化物，較佳為芳基碘化物或雜芳基碘化物進行反應。

式 I'' 之炔類為已知，例如，來自 WO 95 / 306 51。

式 I'' 之炔類與芳基鹵化物或雜芳基鹵化物的反應係進行於惰性稀釋劑中，例如，芳香族，非芳香族或經鹵化之碳氫化合物類，例如，鹵化之碳氫化合物，如二氯甲烷，氯仿或甲苯；醯胺類，例如，二甲基甲醯胺；醚類，例如，二噁烷或四氫呋喃；或亞砷類，例如，二甲亞砷；或那些惰性稀釋劑類之混合物，若需要，在酸性結合劑的存在下，例如，無機鹼類或有機鹼類，例如，三級胺，例如，三乙胺，N-甲基哌啶或吡啶，若需要，在一種或多種過渡金屬鹽類之存在下，例如，鹵化銅或鹵化鈮，例如，碘化銅或二氯化鈮，且若需要，在一種或多種過渡金屬複合物或過渡金屬複合物鹽類之存在下，例如，雙（三芳基或三烷基）二鹵化鈮，例如，雙（三苯膦）二氯化鈮，溫度為自 -80 至 $+200^\circ\text{C}$ ，較佳為自 0 至 $+60^\circ\text{C}$ 。

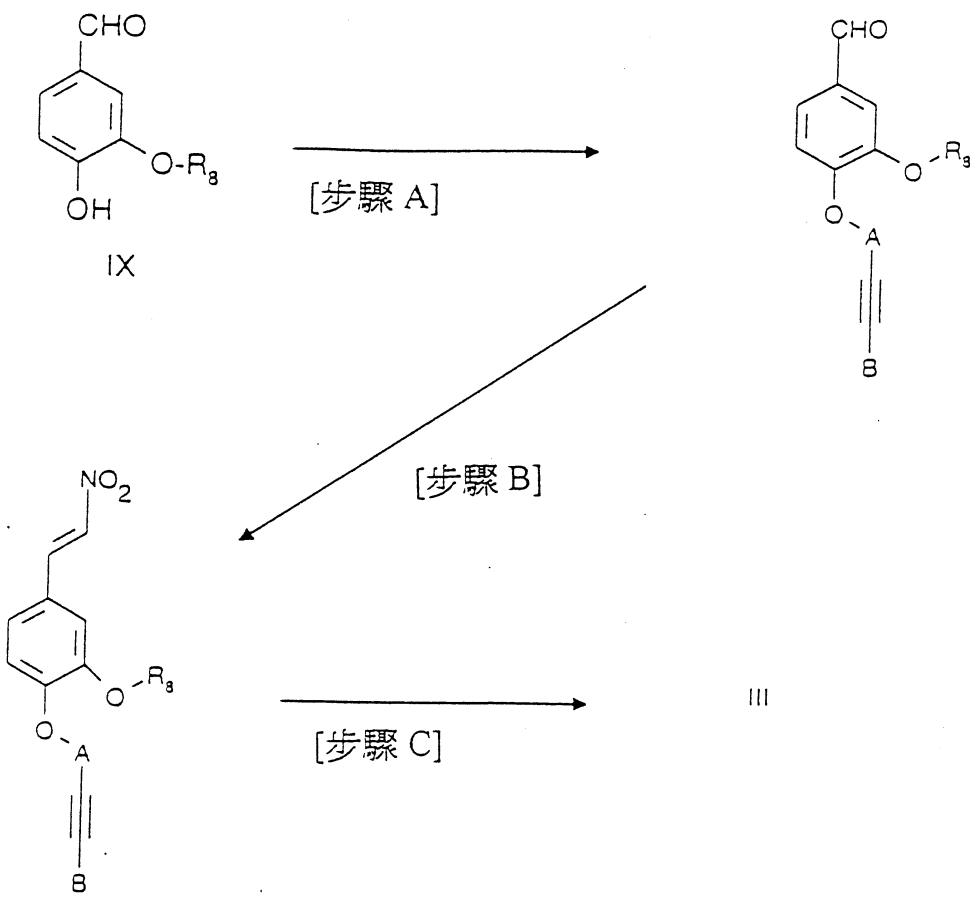
五、發明說明 (15)

重要之中間物可如下列所製備：

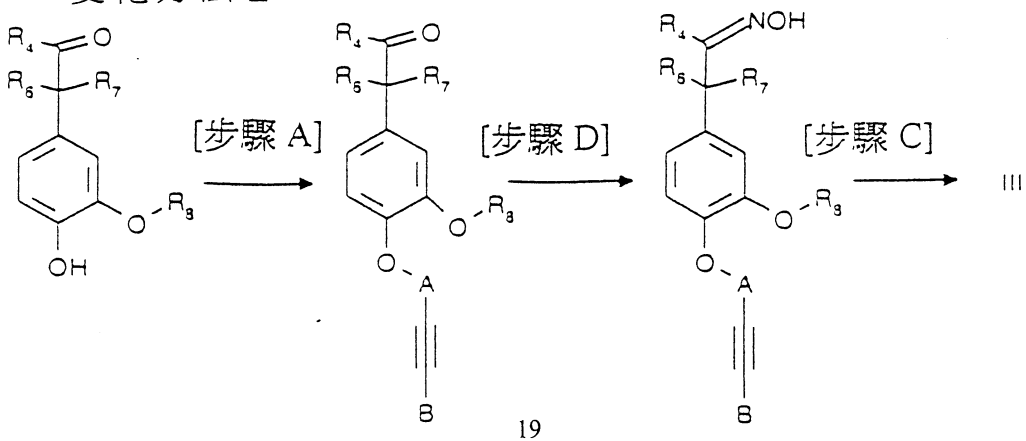
a a) 式 I I I 之胺類可依照下列變化方法而被製備

:

變化方法 1



變化方法 2



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明(17)

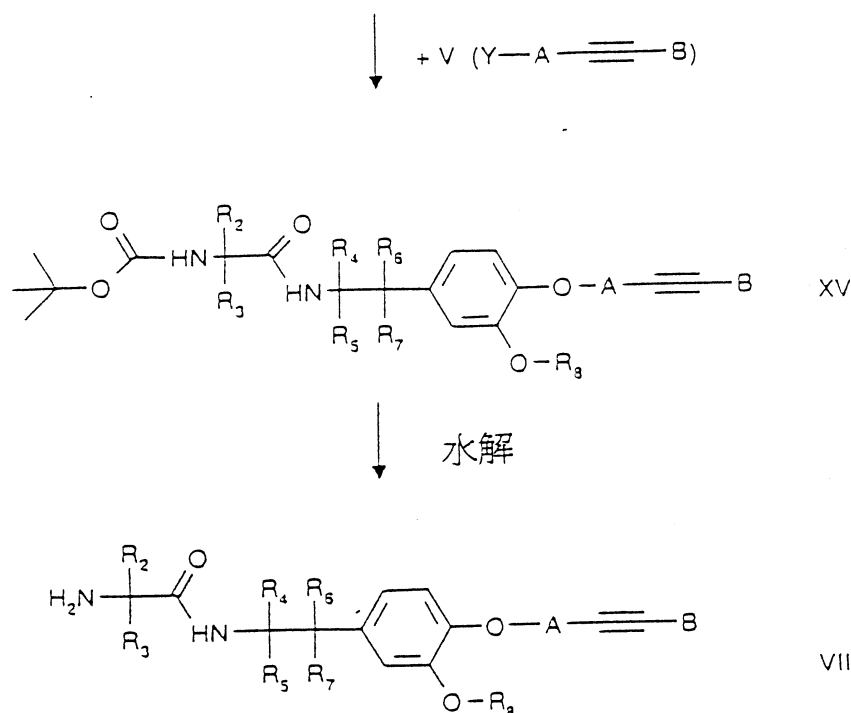
之反應係進行於惰性稀釋劑中，例如，於有機羧酸中，例如，醋酸，可選擇地在該羧酸之銨鹽存在下，例如，醋酸銨，溫度為自 0°C 至 $+120^{\circ}\text{C}$ 。

步驟 C 包括未飽和氮化合物之還原。該反應係進行於惰性稀釋劑中，例如，醚類，例如，二乙醚，二噁烷或四氫呋喃，或醇類，例如，甲醇，乙醇或異丙醇，與氫化硼，氫化硼複合物，例如，氫化硼與四氫呋喃之複合物，鹼金屬氫化硼類，鹼金屬氫化鋁類，例如，氫化鋰鋁，或烷氧基氫化鋁，或與氫，若需要，於過渡金屬或過渡金屬化合物存在下，例如，鎳，溫度為自 50°C 至 $+250^{\circ}\text{C}$ 。

步驟 D 包括醛或酮與羥基胺或羥基胺鹽之反應。該反應係進行於惰性稀釋劑中，例如，醇類，例如，甲醇，乙醇或異丙醇，醚類，例如，二乙醚，二噁烷或四氫呋喃，醯胺類，例如，二甲基甲醯胺，或於水中，或那些惰性稀釋劑類之混合物，若需要，在有機鹼類或無機鹼類之存在下，例如，三級胺，例如，三乙胺，含氮雜芳基化合物，例如，吡啶，鹼金屬或鹼土金屬碳酸鹽或碳酸氫鹽，例如，碳酸鈉或碳酸鉀，溫度為自 -20°C 至 $+150^{\circ}\text{C}$ 。

步驟 E 包括低級烷基酯類之水解。該反應係進行於惰性稀釋劑中，例如，醇類，例如，甲醇，乙醇或異丙醇，醚類，例如，二乙醚，二噁烷或四氫呋喃，經鹵化之碳氫化合物，例如，二氯甲烷，或於水中，或那些惰性稀釋劑類之混合物，若需要，在鹼類之存在下，例如，鹼金屬或鹼土金屬氫氧化物，或在酸類之存在下，例如，硫酸，氫

五、發明說明(19)



(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

在第一步驟中，通式 X I I I 之胺基酸衍生物，或其羧基活化衍生物，若需要，在催化劑之存在下，若需要，在一酸性結合劑之存下，且若需要，在稀釋劑之存在下，與通式 X I I 之胺類進行反應。

合適的式 X I I I 胺基酸之羧基活化衍生物包括任何羧基活化衍生物，例如，酸性鹵化物類，例如，酸性氯化物類；亦為對稱性或混合性酐類；例如，混合性 O—烷基羧酸酐類；及亦為活化酯類，例如，對—硝基苯基酯類或 N—羥基琥珀醯亞胺酯類，及使用縮合劑，例如，二環己基碳化二亞胺，羰基二咪唑，O—（苯並三唑—1—基）

五、發明說明(20)

—N, N, N', N'—雙(五亞甲基)脲酯 六氟磷酸, O—(苯並三唑—1—基)—N, N, N', N'—雙(四亞甲基)脲酯 六氟磷酸, (苯並三唑—1—基)—三吡咯烷磷酯 六氟磷酸, (苯並三唑—1—基氧基)—三(二甲基胺基)磷酯 六氟磷酸或 O—(苯並三唑—1—基)—N, N, N', N'—四甲基脲酯 六氟磷酸進行原位生產之活化形式胺基酸。

相當於式 X I I I 胺基酸之混合酐類可經由式 X I I I 胺基酸與氯甲酸酯類, 例如, 氯甲酸烷基酯類, 較佳為氯甲酸異丁基酯, 若需要, 於酸性結合劑存在下, 例如, 無機鹼或有機鹼, 例如, 三級胺, 如三乙胺, 吡啶, N—甲基哌啶或 N—甲基嗎啉, 進行反應而製備。

式 X I I I 胺基酸, 或式 X I I I 胺基酸之羧基—活化衍生物類, 與式 X I I 之胺類的反應係進行於惰性稀釋劑中, 例如, 芳香族, 非芳香族或經鹵化之碳氫化合物類, 例如, 氯化的碳氫化合物, 如二氯甲烷或甲苯; 酮類, 例如, 丙酮; 酯類, 例如, 乙酸乙酯; 醯胺類, 例如, 二甲基甲醯胺; 腈類, 例如, 乙腈; 或醚類, 例如, 四氫呋喃, 二噁烷, 二乙醚或第三丁基甲基醚; 或那些惰性稀釋劑類之混合物, 若需要, 在酸性結合劑的存在下, 例如, 無機鹼或有機鹼, 例如, 三級胺, 如三乙胺, 吡啶, N—甲基哌啶或 N—甲基嗎啉, 於溫度自—80至+150℃, 較佳為自—40至+40℃。

在第二步驟中, 式 X I V 化合物與式 V 化合物進行反

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明(>)

應。式 X I V 化合物與式 V 化合物的反應係進行於惰性稀釋劑中。下列所提及的可作為實施例：芳香族，非芳香族或經鹵化之碳氫化合物類，例如，甲苯或二氯甲烷；酮類，例如，丙酮；酯類，例如，乙酸乙酯；醯胺類，例如，二甲基甲醯胺；腈類，例如，乙腈；醚類，例如，四氫呋喃，二噁烷，二乙醚或第三丁基甲基醚；醇類，例如，甲醇，乙醇，正丁醇，異丙醇或第三丁醇；二甲亞砜；或水；或那些惰性稀釋劑類之混合物。式 X I V 化合物與式 V 化合物的反應係進行於，若需要，在酸性結合劑的存在下。合適的酸性結合劑包括無機鹼類或有機鹼類，例如，鹼金屬或鹼土金屬氫氧化物類，醇鹽類或碳酸鹽類，例如，氫氧化鈉，氫氧化鉀，甲醇鈉，甲醇鉀，乙醇鈉，乙醇鉀，第三丁醇鈉，第三丁醇鉀，碳酸鈉或碳酸鉀。溫度為自 -80 至 $+120^{\circ}\text{C}$ ，較佳為自 0 至 $+120^{\circ}\text{C}$ ；或該反應係於如方法 c) 之描述下進行。

在第三步驟中，式 X V 化合物接著進行酸水解。式 X V 化合物與無機酸或有機酸，例如，礦酸，例如，氫氯酸或硫酸，或羧酸，例如，醋酸或三氟醋酸，或磺酸，例如，甲磺酸或對-甲苯磺酸，之反應係進行於，若需要，於惰性稀釋劑中，例如，芳香族，非芳香族或經鹵化之碳氫化合物類，例如，鹵化之碳氫化合物，例如，二氯甲烷或甲苯；酮類，例如，丙酮；酯類，例如，乙酸乙酯；醚類，例如，四氫呋喃或二噁烷；或水；溫度為自 -40 至 $+150^{\circ}\text{C}$ 。若需要，其亦可能使用不同酸類及不同惰性稀

五、發明說明 (>>>)

釋劑，或酸類其本身作為稀釋劑之混合物。

式 I 化合物在室溫下為油類或固體且因具有價值的殺微生物性質而著名。它們可預防地及治療性地被使用於農業部門或相關領域以供植物－破壞性微生物之控制。根據本發明之式 I 化合物在低濃度比例時不僅以其顯著的殺微生物性，特別是殺真菌性活性而著名，同時亦以其特別容易為植物所容忍而著名。

令人驚訝地是，目前已發現式 I 化合物類具有針對施用目的而言，在植物病原性微生物，特別是真菌之控制中非常有利之生物滅除範圍。其具有非常有利的治療及預防的特性且可用於保護大量的農作物。有了式 I 化合物，才可能抑制或破壞發生在許多有用植物之農作物或該植物之部份（果實，花，葉，莖，塊莖，根）上的害蟲，同時在稍後成長之植物部份，例如，亦受到保護而免於植物病原性真菌的攻擊。

式 I 之新穎化合物被證實在對抗屬於不完全真菌綱（例如，尾孢菌屬（*Cercospora*）），擔子菌綱（*Basidiomycetes*）（例如，柄銹菌屬（*Puccinia*））及子囊菌綱（*Ascomycetes*）（例如，麥草粉露菌屬（*Erysiphe*）及黑星菌屬（*Venturia*））且特別是，對抗卵孢菌綱（*Oomycetes*）（例如，單軸黴屬（*Plasmopara*），霜黴屬（*Peronospora*），腐黴屬（*Pythium*）及疫黴屬（*Phytophthora*））等真菌綱之特定菌種特別有效。它們在植物保護中因此代表控制植物病原性真菌之組成物中具有

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂

線

五、發明說明 (7)

價值之添加物。式 I 化合物亦可被使用作為敷料以供保護種子（果實，塊莖或花粉粒）及植物切口以免於真菌感染並對抗發生於土壤中之植物病原性真菌。

本發明亦相關於包括式 I 化合物類作為活性成分之組成物類，特別是植物保護性組成物類，且相關於其在農業領域或相關領域之用途。

此外，本發明包括這些組成物類之製備，其中該活性成分與一種或多種本文所述之物質或物質族群加以均質地混合。亦包括治療植物之方法，其包括應用式 I 之新穎化合物類或新穎組成物類。

在本發明範疇內被保護之標的農作物包括，例如，下列的植物種類：穀物類（小麥，大麥，裸麥，燕麥，稻米，玉蜀黍，高粱及相關品種）；甜菜類（甜菜及飼料甜菜類）；梨果類，堅果及軟果（蘋果類，梨類，桃類，水蜜桃類，杏仁類，櫻桃類，草莓類，懸鉤子類及藍莓類）；豆科植物類（豆類，金麥豌豆（lentil），豌豆，黃豆）；油脂作物類（油菜，芥菜，罌粟，橄欖，向日葵，椰子，蓖麻油脂作物，可可亞豆，花生）；瓜類植物（南瓜類，黃瓜類，甜瓜類）；纖維性植物類（棉花，亞麻，麻，黃麻）；柑桔屬水果（橘類，檸檬類，柚子，桠柑類）；蔬菜類（菠菜，萵苣，蘆筍類，包心菜類，胡蘿蔔類，洋蔥類，蕃茄類，馬鈴薯類，紅椒）；月桂科（*Lauraceae*）植物（酪梨類，桂皮，樟腦）及其他植物類，例如，煙草，胡桃，咖啡，甘蔗，茶葉，胡椒，藤類，蛇麻類，香蕉類及

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂 線

五、發明說明 (54)

天然橡膠植物類，及觀賞用植物類。

式 I 化合物一般以組成物的形式施用，且可以與其他的活性成分同時或連續地施用至欲被處理的區域或植物上。那些其他的活性成分可以是肥料，微營養素提供者或其他影響植物生長的製劑類。亦可能使用選擇性的除草劑類或殺蟲劑類，殺真菌劑類，殺細菌劑類，殺線蟲劑類，殺蝸牛劑類或數種那些製劑之混合物，若需要，可與在配方技藝中所習用之其他載劑類，界面活性劑類或其他增進應用的佐劑類一起使用。

式 I 化合物可與其他活性成分例如，肥料，微營養素提供者或其他可發生具有意外的協乘效果之農作物保護產物，特別是其他殺真菌劑，，一起混合。較佳之混合夥伴為：

氮雜五節環類 (azoles) ， 例如，吡可唑 (azaconazole) ， 必特坦 (bitertanol) ， 溴目可唑 (bromuconazole) ， 西伯可唑 (cyproconazole) ， 戴芬可唑 (difenoconazole) ， 戴尼可唑 (diniconazole) ， 艾波西可唑 (epoxiconazole) ， 芬比可唑 (fenbuconazole) ， 氟醯可唑 (fluquinconazole) ， 氟西來唑 (flusilazole) ， 氟特利活 (flutriafol) ， 六可唑 (hexaconazole) ， 尹麥拉利 (imazalil) ， 尹米苯可唑 (imibenconazole) ， 依波可唑 (ipconazole) ， 美他可唑 (metconazole) ， 麥克比坦爾 (myclobutanil) ， 伯夫唑鹽 (perfurazoate) ， 班可唑 (penconazole) ， 皮里芬克司 (pyrifenox) ， 伯若克拉滋 (

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (75)

prochloraz)，伯比可唑 (propiconazole)，特比可唑 (ebuconazole)，四可唑 (tetraconazole)，特利狄風 (triadimefon)，特利狄美羅 (triadimenol)，特利氟米唑 (triflumizole)，特利提可唑 (triticonazole)；

嘧啶基伯醇類，例如，安西米醇 (ancymidol)，芬那里醇 (fenarimol)，奴里醇 (nuarimol)；

2-胺基-嘧啶類，例如，比匹里麥特 (bupirimate)，戴美利莫 (dimethirimol)，艾利莫 (ethirimol)；

嗎啉類，例如，多晶莫非 (dodemorph)，芬波匹丁 (fenpropidin)，芬白匹莫非 (fenpropimorph)，螺克米 (spiroxamin)，特利狄莫非 (tridemorph)；

苯胺基嘧啶類，例如，西伯狄尼 (cyprodinil)，美盤匹里 (mepanipyrim)，匹里美尼 (pyrimethanil)；

吡唑類，例如，芬匹可尼 (fempiclonil)，氟戴可若尼 (fludioxonil)；

苯基醯胺類，例如，苯那來克西 (benalaxyl)，氟拉克西 (furalaxyl) 美他克西 (metalaxyl)，R-美他克西 (R-metalaxyl)，歐佛拉西 (ofurace)，歐克戴西 (oxadixyl)；

苯並咪唑類，例如，苯喏米 (benomyl)，卡苯戴里 (carbendazim)，得巴卡伯 (debacarb)，氟巴里唑 (fuberidazole)，噻奔唑 (thiabendazole)；

二羧醯亞胺類，例如，克羅里那特 (chlozolate)，戴克羅若林 (dichlozoline)，尹波汀 (iprodione)，麥克

五、發明說明 (56)

若林 (myclozoline)，波若西米酮 (procymidone)，凡克若林 (vinclozolin)；

羧醯胺類，例如，卡伯克西 (carboxin)，芬氟蘭 (fenfuram)，氟托蘭尼 (flutolanil)，曼白尼勒 (mepronil)，歐卡伯克西 (oxycarboxin)，噻氟拉醯胺 (thiufuzamide)；胍類，例如，瓜拉汀 (guazatine)，朵叮 (dodine)，尹米歐克啉 (iminooctadine)；史特比尿類 (strobilurines)，例如，歐若克司特賓 (azoxystrobin)，克羅梭西－甲基 (kresoxim-methyl)，美托米若史特賓 (metominostrobin)，S S F-129，C G A 279202；

二硫基胺基甲酸酯類，例如，法斑 (ferbam)，曼可伯 (mancozeb)，曼伯 (maneb)，曼替蘭 (metiram)，波比伯 (propineb)，里蘭 (thiram)，利伯 (zineb)，利蘭 (ziram)；

N-鹵甲基硫基，例如，卡白他佛 (captan)，卡巴坦 (captan)，二氯氟尼得 (dichlofluanid)，氟米得 (fluoromide)，活配特 (folpet)，托利弗尼得 (tolyfluanid)；

銅化合物，例如，伯狄烏克 (Bordeaux) 混合物，氫氧化銅，氧氯化銅，硫酸銅，氧化亞銅，曼銅 (mancopper)，8-羥氧氮苯-銅；

硝基酚衍生物，例如，二若卡伯 (dinocap)，硝拉 (nitrothal)-異丙基；

五、發明說明 (>))

有機磷衍生物，例如，艾狄芬佛司 (edifenphos)，尹伯苯佛司 (iprobenphos)，異伯硫烷 (isoprothiolane)，弗戴芬 (phosdiphen)，匹拉佛司 (pyrazophos)，托克弗司 (toclofos) — 甲基；

及其它各種化合物，例如，阿起苯來 (acibenzolar) — S — 甲基，安尼來吡 (anilazine)，伯拉司西汀 (blasticidin) — S，起若美里那特 (chinomethionat)，克若尼伯 (chloroneb)，克若太若尼 (chlorothalonil)，西莫克尼 (cymoxanil)，戴克隆 (dichlone)，戴克美吡 (diclomezine)，戴克南 (dicloran)，戴也若芬卡伯 (diethofencarb)，戴美馬弗 (dimethomorph) 戴里隆 (dithianon)，艾特里戴啞 (etridiazole)，法莫克冬 (famoxadone)，芬汀 (fentin)，發米隆 (ferimzone)，弗錄里南 (fluazinam)，弗硫醯胺 (flusulfamide)，芬害克得米得 (fenhexamid)，佛司提 (fosetyl) — 鋁，海美啞羅 (hymexazol)，凱舒美新 (kasugamycin)，美沙弗卡伯 (methasuifocarb)，潘西科隆 (pencycuron)，苯酞 (phthalide)，多可西 (polyoxins)，伯苯啞 (probenazole)，伯潘卡巴 (propamocarb)，吡咯啞隆 (pyroquilon)，啞氧芬 (quinoxifen)，啞托林 (quintozene)，硫，三啞氧化物 (triazoxide)，三環啞 (tricyclazole)，三弗林 (triforine)，巴利的黴素 (validamycin)。

適合的載劑和界面活性劑可為固體或液體且為配方技術中可用的物質，例如，天然或再生的礦物質，溶劑，分

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (8)

散劑，濕潤劑，膠黏劑，增稠劑，黏合劑或肥料。此種載劑及添加物被描述於，例如，於 WO 95 / 30651 中。

施用式 I 化合物或含有至少一種該化合物的農業化學組成物之較佳方法係施用至葉子（葉子施用），施用的頻率及施用的速率將視對應的病原之感染危險而定。亦可將式 I 化合物施用於種子穀粒（包覆），其係藉由將穀粒浸漬於活性成分的液體配方中或用固體配包覆它們。

式 I 化合物以未修飾的形式使用，或，較佳地連同習用於配方技藝中的佐劑一起使用，且為此目的，可以有利地依已知的方式將它們配成，例如，可乳化的濃縮物，可塗覆的糊劑，可直接噴灑的或可稀釋的溶液，稀釋的乳化液，可濕性粉末，可溶性粉末，粉塵，顆粒，以及包封在，例如，聚合物質內。當為組成物的形態，依照所欲的目標及優勢的環境來選擇施用的方法，如噴灑、霧化、撒粉、散播、塗覆或傾到。

有利上的施用比率通常為每公頃（ha）自 1 克至 2 公斤的活性成分（a.i.），較佳地為自 10 克至 1 公斤 a.i./ha，特別是自 25 克至 750 a.i./ha。當用作為種子浸泡劑時，方便上的使用比率為每公斤種子自 0.001 克至 1.0 克之活性成分。

配方，即，包括式 I 之化合物（活性成分）且，當合適時，一種固體或液體佐劑之組成物，製劑或混合物，其係以已知方法製備，例如，藉由均質地混合及／或磨碎該

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

訂
線

五、發明說明 (29)

活性成分與擴張劑，例如，溶劑或固體載劑且，當合適時，界面活性化合物（界面活性劑）。

於配方技藝中所慣用的其它界面活性劑為習於此技藝者所知的或可發現於相關文獻中。

農業化學組成物通常包括 0.01 至 99 重量%，較佳為 0.1 至 95 重量%的式 I 化合物，99.99 至 1 重量%，較佳為 99.9 至 5 重量%的固體或液體佐劑，及 0 至 25 重量%，較佳為 0.1 至 25 重量%的界面活性劑。

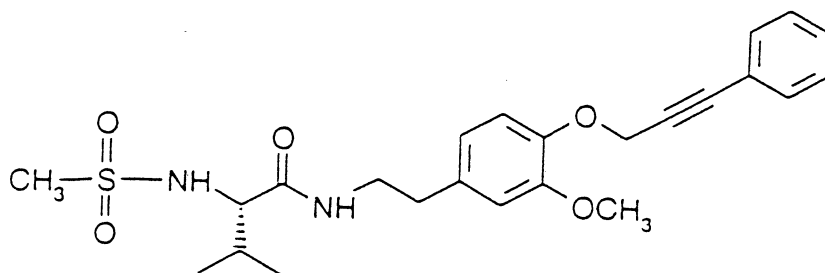
雖然如此，商品將較佳為配成濃縮物，最終使用者將通常使用稀釋的配方。

該組成物亦可包括另外之成分，例如，安定劑，消泡劑，黏度調節劑，黏合劑及膠黏劑，以及肥料或其它可獲得特殊效果的活性成分。

以下的實施例將列舉說明上述本發明，而非以任何方式限制本發明之範疇。溫度以攝氏度表示。

式 I 化合物之製備實施例：

實施例 1.001：(S)-2-(甲基磺醯基-胺基)-3-甲基-丁酸 N-{2-[3-甲氧基-4-(3-苯基-2-炔丙-1-基氧基)-苯基]-乙基}-醯胺

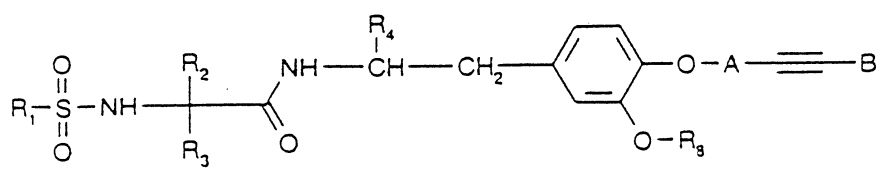


五、發明說明(7c)

2.5 克 (S) - 2 - (甲基磺醯基 - 胺基) - 3 - 甲
基 - 丁酸 N - { 2 - (4 - 羥基 - 3 - 甲氧基 - 苯基)
- 乙基 } - 醯胺及 2.7 克 甲苯 - 4 - 磺酸 (3 - 苯基 - 2
- 炔丙 - 1 - 基) 酯一起與 12 毫升 1 M 甲醇鈉溶液及添
加於 50 毫升 甲醇中之 20 毫克 碘化鉀回流加熱三小時。
冷卻該反應混合物且導入 200 毫升飽和氯化鈉溶液。每
一次使用 200 毫升醋酸乙酯萃取兩次。該有機相被組合
，以硫酸鎂乾燥及濃縮。該殘留物於具有醋酸乙酯 / 正己
烷 (2 : 1) 之矽膠上進行急驟層析，產生 (S) - 2 -
(甲基磺醯基 - 胺基) - 3 - 甲基 - 丁酸 N - { 2 - [3 - 甲
氧基 - 4 - (3 - 苯基 - 2 - 炔丙 - 1 - 基氧基) - 苯基] - 乙
基 } - 醯胺，其自醋酸乙酯 / 正己烷中再結晶，熔點 130 - 132 °C。

列於表 1 之實施例以類似的方法獲得。

表 1



化合物 編號	R ₁	R ₂	R ₃	α -C	R ₄	R ₃	A	B	物理數據 熔點°C
1.001	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	130-132
1.002	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-甲基- 苯基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (7)

1.003	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯基	111-113
1.004	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-甲基-苯基	
1.005	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-氯-苯基	
1.006	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-甲基-苯基	
1.007	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-甲氧基-苯基	
1.008	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-CF ₃ -苯基	
1.009	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-CH ₃ CO-苯基	
1.010	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3,5-二- CF ₃ -苯基	樹脂
1.011	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-吡啶基	
1.012	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-吡啶基	
1.013	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-吡啶基	
1.014	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-噻吩基	
1.015	甲基	氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.016	甲基	氫	2-丙基	S	氫	烯丙基	-CH ₂ -	苯基	
1.017	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-	苯基	
							CH(CH ₃)		
							-		
1.018	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-	苯基	
							C(CH ₃) ₂		
							-		
1.019	甲基	甲基	甲基	-	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.020	甲基	四亞	四亞	甲基	-	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
		甲基							
1.021	甲基	氫	乙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂 線

五、發明說明 (2)

1.022	甲基	氫	乙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.023	甲基	氫	乙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.024	甲基	氫	環丙基	R,S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.025	甲基	氫	環丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.026	甲基	氫	2-丁基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.027	甲基	氫	2-甲基- 2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.028	甲基	氫	環己基	R,S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.029	甲基	氫	環丙基甲 基	R,S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.030	甲基	氫	1-羥基- 乙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.031	甲基	氫	2-(SMe)- 乙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.032	甲基	氫	氫硫基甲 基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.033	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	129-130
1.034	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯 基	82-83
1.035	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基	125-127
1.036	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-溴-苯 基	129-131
1.037	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-MeO- 苯基	72-75
1.038	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-NO ₂ -苯 基	139-142
1.039	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4- CH ₃ OOC- 苯基	133-134
1.040	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-CF ₃ -苯 基	150-152
1.041	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-CF ₃ O- 苯基	
1.042	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-CH ₃ CO- 苯基	120-125

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (33)

1.043	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-CN-苯基	
1.044	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-(第三丁基)-苯基	
1.045	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-乙基-苯基	
1.046	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-CHF ₂ O-苯基	
1.047	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-PhCO-苯基	
1.048	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-NH ₂ -苯基	
1.049	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-MeS-苯基	
1.050	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-溴-苯基	108-110
1.051	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-氟-苯基	117-119
1.052	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-氯-苯基	120-122
1.053	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-MeO-苯基	101-103
1.054	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-CF ₃ -苯基	79-80
1.055	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-甲基-苯基	94-96
1.056	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-NO ₂ -苯基	78-80
1.057	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-NH ₂ -苯基	
1.058	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-EtOOC-苯基	
1.059	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-MeOOC-	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明(34)

1.060	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基 3-CN-苯基
1.061	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-溴-苯基 65-67
1.062	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-氟-苯基
1.063	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-氯-苯基 105-107
1.064	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-MeO-苯基
1.065	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-CF ₃ -苯基 115-120
1.066	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-甲基-苯基 92-94
1.067	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-NO ₂ -苯基
1.068	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-CF ₃ O-苯基
1.069	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-MeS-苯基
1.070	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3,4-二-氟-苯基 118-121
1.071	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3,4-二-氯-苯基 135-137
1.072	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3,4-二-甲基-苯基 127-130
1.073	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-氟-4-甲基-苯基 128-131
1.074	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-甲基-4-氟-苯基
1.075	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-氯-4-甲基-苯基 139-141

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂線

五、發明說明 (35)

1.076	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	基 3-氟-4- 氯-苯基	130-133
1.077	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-氟-4- 溴-苯基	
1.078	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-甲基- 4-溴-苯 基	
1.079	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-甲基- 4-氟-苯 基	
1.080	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2,4-二- 氯-苯基	121-122
1.081	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-氟-4- 溴-苯基	
1.082	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2,4-二- 甲基-苯 基	113-115
1.083	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-氯-4- CF ₃ -苯基	
1.084	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-CF ₃ -4- 氯-苯基	
1.085	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2,4-二- MeO-苯 基	
1.086	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2,5-二- 氯-苯基	137-139
1.087	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-氯-5- CF ₃ -苯基	148-150
1.088	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2,5-二- 甲基-苯 基	
1.089	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-MeO- 5-氯-苯 基	
1.090	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-甲基-	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (36)

							5-氯-苯基	
1.091	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3,5-二- 154-155
							氯-苯基	
1.092	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-氟-5-
							NO ₂ -苯基	
1.093	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3,5-二- 145-147
							CF ₃ -苯基	
1.094	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3,5-二-
							甲基-苯基	
1.095	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2,4,5- 129-131
							三-氯-苯基	
1.096	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2,3,4,5
							,6-五-氟-苯基	
1.097	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-吡啶基
1.098	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	6-甲基-2-吡啶基
1.099	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-氯-5-CF ₃ -2-吡啶基
1.100	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	5-CF ₃ -吡啶基
1.101	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-吡啶基
1.102	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-吡啶基
1.103	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-嘧啶基
1.104	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-吡唑基
1.105	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-噻吩 154-155

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂線

五、發明說明 (3)

1.106	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	基 5-甲基- 2-噁吩 基
1.107	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	基 2,4,5- 三-甲基 -噁吩基
1.108	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-苯並 噁唑基
1.109	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-喹啉 基
1.110	乙基	氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.111	乙基	氫	2-丙基	S	氫	烯丙基	-CH ₂ -	苯基
1.112	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-	苯基
1.113	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-	CH(CH ₃) 苯基 C(CH ₃) ₂ -
1.114	乙基	甲基	甲基	-	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.115	乙基	四亞 甲基	四亞甲基	-	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.116	乙基	氫	乙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.117	乙基	氫	乙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.118	乙基	氫	乙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.119	乙基	氫	環丙基	R,S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.120	乙基	氫	環丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.121	乙基	氫	2-丁基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.122	乙基	氫	2-甲基- 2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.123	乙基	氫	環己基	R,S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.124	乙基	氫	環丙基甲 基	R,S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.125	乙基	氫	1-羥基- 乙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.126	乙基	氫	2-(SMe)- 乙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明(38)

1.127	乙基	氫	氫硫基甲	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
			基						
1.128	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	96-98
1.129	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯	135-137
								基	
1.130	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-CF ₃ -苯	
								基	
1.131	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-CF ₃ O-	
								苯基	
1.132	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-CHF ₂ -	
								苯基	
1.133	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-氯-苯	
								基	
1.134	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-CF ₃ -苯	
								基	
1.135	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-甲基-	
								苯基	
1.136	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3,5-二- 樹脂	
								CF ₃ -苯基	
1.137	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-吡啶	
								基	
1.138	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-氯-5-	
								CF ₃ -2-吡	
								啶基	
1.139	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	5-CF ₃ -吡	
								啶基	
1.140	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-吡啶	
								基	
1.141	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-噻吩	
								基	
1.142	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.143	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	烯丙基	-CH ₂ -	苯基	
1.144	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-	苯基	
								CH(CH ₃)	
1.145	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-	苯基	
								C(CH ₃) ₂	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (29)

1.146	Me ₂ N	甲基	甲基	-	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.147	Me ₂ N	四亞	四亞甲基	-	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
		甲基						
1.148	Me ₂ N	氫	乙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.149	Me ₂ N	氫	乙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.150	Me ₂ N	氫	乙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.151	Me ₂ N	氫	環丙基	R,S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.152	Me ₂ N	氫	環丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.153	Me ₂ N	氫	2-丁基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.154	Me ₂ N	氫	2-甲基-	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
			2-丙基					
1.155	Me ₂ N	氫	環己基	R,S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.156	Me ₂ N	氫	環丙基甲	R,S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
			基					
1.157	Me ₂ N	氫	1-羥基-	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
			乙基					
1.158	Me ₂ N	氫	2-(SMe)-	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
			乙基					
1.159	Me ₂ N	氫	氫硫基甲	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
			基					
1.160	異丙	氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	苯基
	基							
1.161	異丙	氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯
	基							基
1.162	異丙	氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	3,5-二-
	基							CF ₃ -苯基
1.163	丙基	氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.164	丙基	氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯
								基
1.165	丙基	氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	3,5-二-
								CF ₃ -苯基
1.166	3-氯	氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	苯基
	-丙							
	基							
1.167	3-氯	氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明(40)

	-丙基						基
1.168	3-氯 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	3,5-二- CF ₃ -苯基
	-丙基						
1.169	CF ₃ 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.170	CF ₃ 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
1.171	CF ₃ 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	3,5-二- CF ₃ -苯基
1.172	CF ₃ CH ₂ 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	苯基
	²						
1.173	CF ₃ CH ₂ 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
	²						
1.174	CF ₃ CH ₂ 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	3,5-二- CF ₃ -苯基
	²						
1.175	MeHN 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.176	MeHN 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
1.177	MeHN 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	3,5-二- CF ₃ -苯基
1.178	乙烯 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	苯基
	基						
1.179	乙烯 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
	基						
1.180	乙烯 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	3,5-二- CF ₃ -苯基
	基						
1.181	1-丁 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	苯基
	基						
1.182	1-丁 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
	基						
1.183	1-丁 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	3,5-二- CF ₃ -苯基
	基						
1.184	2-丁 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	苯基
	基						
1.185	2-丁 氫	2-丙基	S	甲基	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明(4)

1.186	基 2-丁 氫 基	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ -	基 3,5-二- CF ₃ -苯基
1.187	CH ₃ SO 氫 2-CH ₂ -	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ -	苯基
1.188	CH ₃ SO 氫 2-CH ₂ -	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
1.189	CH ₃ SO 氫 2-CH ₂ -	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ -	3,5-二- CF ₃ -苯基
1.190	CH ₃ OO 氫 CCH ₂ -	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ -	苯基
1.191	CH ₃ OO 氫 CCH ₂ -	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
1.192	CH ₃ OO 氫 CCH ₂ -	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ -	3,5-二- CF ₃ -苯基
1.193	環己 氫 基	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ -	苯基
1.194	環己 氫 基	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
1.195	環己 氫 基	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ -	3,5-二- CF ₃ -苯基
1.196	環戊 氫 基	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ -	苯基
1.197	環戊 氫 基	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
1.198	環戊 氫 基	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ -	3,5-二- CF ₃ -苯基
1.199	乙基 氫	2-丙基	S	氫 甲基	-CH ₂ -	2-甲氧 基-5-淤 MeOOC- 苯基
1.200	異丙 氫 基	2-丙基	S	氫 甲基	-CH ₂ -	苯基
1.201	異丙 氫 基	2-丙基	S	氫 甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
1.202	異丙 氫	2-丙基	S	氫 甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (42)

	基						基	
1.203	丙基 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.204	丙基 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯	131-133
							基	
1.205	丙基 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯	
							基	
1.206	3-氯 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
	-丙							
	基							
1.207	3-氯 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯	161-163
	-丙						基	
	基							
1.208	3-氯 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯	
	-丙						基	
	基							
1.209	CF ₃ 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.210	CF ₃ 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯	樹脂
							基	
1.211	CF ₃ 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯	
							基	
1.212	CF ₃ CH 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
	²							
1.213	CF ₃ CH 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯	
	²						基	
1.214	CF ₃ CH 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯	
	²						基	
1.215	MeHN 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
1.216	MeHN 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯	
							基	
1.217	MeHN 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯	
							基	
1.218	乙烯 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基	
	基							
1.219	乙烯 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯	136-137
	基						基	
1.220	乙烯 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂 線

五、發明說明 (4)

1.221	基 1-丁 氫 基	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	基 苯基
1.222	基 1-丁 氫 基	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
1.223	基 1-丁 氫 基	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯 基
1.224	基 2-丁 氫 基	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.225	基 2-丁 氫 基	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
1.226	基 2-丁 氫 基	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯 基
1.227	CH ₃ SO 氫 2CH ₂ -	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.228	CH ₃ SO 氫 2CH ₂ -	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
1.229	CH ₃ SO 氫 2CH ₂ -	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯 基
1.230	CH ₃ OO 氫 CCH ₂ -	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.231	CH ₃ OO 氫 CCH ₂ -	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
1.232	CH ₃ OO 氫 CCH ₂ -	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯 基
1.233	環己 氫 基	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.234	環己 氫 基	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
1.235	環己 氫 基	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯 基
1.236	環戊 氫 基	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	苯基
1.237	環戊 氫 基	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氯-苯 基
1.238	環戊 氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明(44)

基						基
1.239	甲基	氫	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ - 苯基
1.240	甲基	氫	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ - 4-氯-苯基
1.241	甲基	氫	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ - 4-氟-苯基
1.242	乙基	氫	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ - 苯基
1.243	乙基	氫	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ - 4-氯-苯 153-155
1.244	乙基	氫	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ - 4-氟-苯基
1.245	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ - 苯基
1.246	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ - 4-氯-苯基
1.247	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	甲基 甲基	-CH ₂ - 4-氟-苯基
1.248	乙基	氫	2-丙基	S	氫 甲基	-CH ₂ - 苯基
1.249	乙基	氫	2-丙基	S	氫 甲基	-CH ₂ - 4-氯-苯 117-122
1.250	乙基	氫	2-丙基	S	氫 甲基	-CH ₂ - 4-氟-苯基
1.251	1-吡咯啉基	氫	2-丙基	S	氫 甲基	-CH ₂ - 苯基
1.252	1-吡咯啉基	氫	2-丙基	S	氫 甲基	-CH ₂ - 4-氯-苯 樹脂
1.253	1-吡咯啉基	氫	2-丙基	S	氫 甲基	-CH ₂ - 4-氟-苯基
1.254	甲基	氫	2-丙基	S	氫 甲基	-CH ₂ - 4-甲基-苯基
1.255	乙基	氫	2-丙基	S	氫 甲基	-CH ₂ - 4-甲基- 103-105
1.256	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫 甲基	-CH ₂ - 4-甲基-苯基

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (45)

1.257	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2- CH ₃ OOC- 苯基	
1.258	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2- CH ₃ OOC- 苯基	70-73
1.259	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2- CH ₃ OOC- 苯基	
1.260	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2,4-二- 氟-苯基	
1.261	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2,4-二- 氟-苯基	113-114
1.262	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2,4-二- 氟-苯基	
1.263	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	1-萘基	
1.264	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	1-萘基	98-100
1.265	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	1-萘基	
1.266	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-3- 氯-苯基	
1.267	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-3- 氯-苯基	102-104
1.268	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-3- 氯-苯基	
1.269	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	1-丁基	樹脂
1.270	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	1-丁基	油
1.271	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	1-丁基	94-95
1.272	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-CH ₃ -2- 丙基	
1.273	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-CH ₃ -2- 丙基	
1.274	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	2-CH ₃ -2- 丙基	
1.275	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	環戊基	
1.276	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	環戊基	
1.277	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	環戊基	

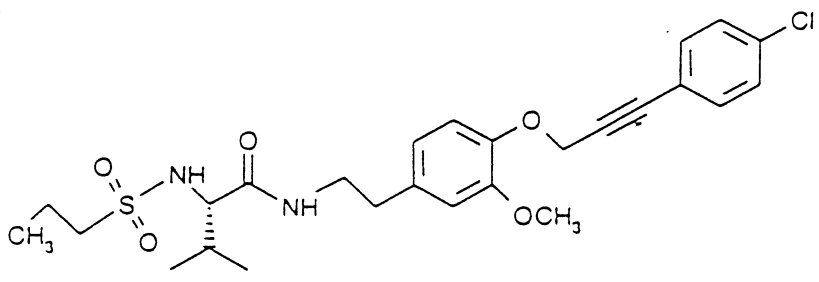
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明(46)

1.278	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	環己基	
1.279	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	環己基	
1.280	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	環己基	
1.281	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-氟-4- 甲基-苯 基	
1.282	乙基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-氟-4- 甲基-苯 基	128-131
1.283	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	3-氟-4- 甲基-苯 基	
1.284	Me ₂ N	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯 基	131-133
1.285	甲基	氫	2-丙基	S	氫	甲基	-CH ₂ -	4-氟-苯 基	136-138

實施例 2.001 : (S) - 2 - (丙基磺醯基 - 胺基) - 3 - 甲基 - 丁酸 N - [2 - { 3 - 甲氧基 - 4 - (3 - (4 - 氯苯基) - 2 - 炔丙 - 1 - 基) - 苯基 } - 乙基] - 醯胺



a) 32.9 克 BOC - L - 纈胺酸及 16.7 毫升 N - 甲基嗎啉溶解於 350 毫升四氫呋喃中且冷卻至 - 20 °C 。 將 19.8 毫升異丁基氯甲酸酯逐滴加入該溶液中持續 15 分鐘 。 該混合物被攪拌 30 分鐘 ， 在此期間 ， 溫度提

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明(ψ)

升至 -7°C 。該混合物然後被冷卻至 -20°C ，且逐滴加入 35.4 克於 50 毫升四氫呋喃中之 2-(4-苄氧基-3-甲氧基-苯基)-乙基胺持續 10 分鐘。該反應混合物在 -20°C 被攪拌 30 分鐘及然後於室溫 4 小時。導入 300 毫升 1 N 氫氯酸。每一次使用 400 毫升醋酸乙酯進行兩次萃取。該有機相被以 300 毫升 1 N 氫氯酸洗滌一次及以 300 毫升飽和氯化鈉溶液洗滌一次，以氯化鎂乾燥及濃縮，產生 (S)-2-(第三丁氧基羰基-胺基)-3-甲基-丁酸 N-[2-(4-苄氧基-3-甲氧基-苯基)-乙基]-醯胺，其自醋酸乙酯/正己烷中再結晶，熔點 $115-118^{\circ}\text{C}$ 。

b) 50.4 克 (S)-2-(第三丁氧基羰基-胺基)-3-甲基-丁酸 N-[2-(4-苄氧基-3-甲氧基-苯基)-乙基]-醯胺溶解於 1000 毫升四氫呋喃中且在常壓及室溫下經由 10 克之於活性碳上之 10% 鈀以氫進行氫化 2 小時。經由矽藻土進行抽氣過濾。濾液經由蒸發濃縮。產生油類形式之 (S)-2-(第三丁氧基羰基-胺基)-3-甲基-丁酸 N-[2-(4-羥基-3-甲氧基-苯基)-乙基]-醯胺。

c) 40.4 克 (S)-2-(第三丁氧基羰基-胺基)-3-甲基-丁酸 N-[2-(4-羥基-3-甲氧基-苯基)-乙基]-醯胺，53.0 克甲基-4-磺酸 [3-(4-氯苯基)-2-炔丙-1-基] 酯 (實施例 5.005) 及 180 毫升 1 M 於甲醇中之甲醇鈉溶液於 100

五、發明說明(48)

0 毫升甲醇中回流加熱 3 小時。該反應混合物被濃縮至約三分之一體積且導入 500 毫升醋酸乙酯。每一次使用 300 毫升飽和氯化鈉溶液進行萃取兩次。以硫酸鎂乾燥有機相及濃縮，產生 (S) - 2 - (丁氧基羰基 - 胺基) - 3 - 甲基 - 丁酸 N - [2 - { 3 - 甲氧基 - 4 - (3 - (4 - 氯苯基) - 2 - 炔丙 - 1 - 基氧基) - 苯基 } - 乙基] - 醯胺，其自醋酸乙酯 / 正己烷中再結晶，熔點 141 - 142 °C。

d) 5.8 克 (S) - 2 - (丁氧基羰基 - 胺基) - 3 - 甲基 - 丁酸 N - [2 - { 3 - 甲氧基 - 4 - (3 - (4 - 氯苯基) - 2 - 炔丙 - 1 - 基氧基) - 苯基 } - 乙基] - 醯胺及 5 克濃氫氯酸在 0 °C 於 20 毫升二乙醚及 20 毫升二氯甲烷之混合物中被攪拌 10 分鐘。在室溫下持續攪拌過夜。該反應混合物被導入 100 毫升 2 N 氫氯酸及每一次使用 150 毫升二乙醚進行萃取兩次。該水相以 5 M 氫氧化鈉調整至 pH 11。每一次使用 150 毫升醋酸乙酯進行萃取兩次。該有機相每一次以 50 毫升飽和氯化鈉溶液洗滌兩次，以硫酸鈉乾燥及濃縮，產生 (S) - 2 - 胺基 - 3 - 甲基 - 丁酸 N - [2 - { 3 - 甲氧基 - 4 - (3 - (4 - 氯苯基) - 2 - 炔丙 - 1 - 基氧基) - 苯基 } - 乙基] - 醯胺，其自醋酸乙酯 / 正己烷中再結晶，熔點 115 - 117 °C。

e) 1.5 克 (S) - 2 - 胺基 - 3 - 甲基 - 丁酸 N - [2 - { 3 - 甲氧基 - 4 - (3 - (4 - 氯苯基) - 2

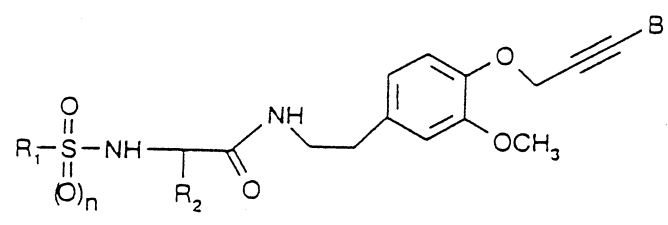
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂 線

五、發明說明(49)

—炔丙—1—基氧基)—苯基}—乙基〕—醯胺及0.5毫升三乙胺溶解於50毫升二噁烷中。加入0.4毫升1—丙烷磺醯基氯化物，且該反應混合物在室溫下攪拌過夜。導入200毫升飽和氯化鈉溶液。每一次使用150毫升醋酸乙酯進行萃取兩次。該有機相以100毫升飽和氯化鈉溶液洗滌一次，以硫酸鎂乾燥及濃縮，產生(S)—2—(丙基磺醯基—胺基)—3—甲基—丁酸 N—〔2—{3—甲氧基—4—(3—(4—氯苯基)—2—炔丙—1—基氧基)—苯基}—乙基〕—醯胺，於具有醋酸乙酯／正己烷(1：1)之矽膠上進行層析且其自醋酸乙酯／正己烷中再結晶，熔點131—133℃。

列於表2之實施例以類似的方法製備。
表2



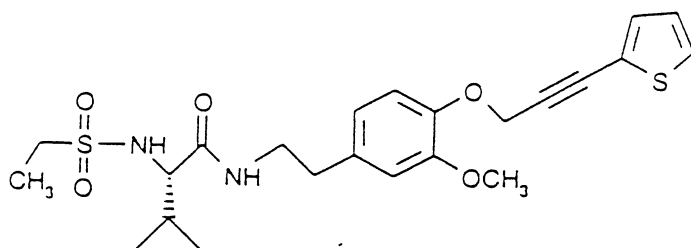
化合物編號	R ₁	n	R ₂	構型	B	物理數據 熔點℃	相同化合 物編號
2.001	2-丙基	1	2-丙基	S	4-氯—苯基	131-133	1.204
2.002	乙烯基	1	2-丙基	S	4-氯—苯基	136-137	1.219
2.003	CF ₃	1	2-丙基	S	4-氯—苯基	樹脂	1.210
2.004	3-氯-丙基	1	2-丙基	S	4-氯—苯基	161-163	1.207
2.005	1-吡咯啶基	1	2-丙基	S	4-氯—苯基	樹脂	1.252
2.006	乙基	0	2-丙基	S	4-氯—苯基	130-134	---
2.007	2-丙基	0	2-丙基	S	4-氟—苯基	樹脂	---
2.008	環己基	0	2-丙基	S	4-氟—苯基	樹脂	---

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (50)

實施例 3.001 : (S) - 2 - (乙基磺醯基 - 胺基) - 3 - 甲基 - 丁酸 N - [2 - { 3 - 甲氧基 - 4 - (3 - (2 - 噻吩基) - 2 - 炔丙 - 1 - 基氧基) - 苯基 } - 乙基] - 醯胺

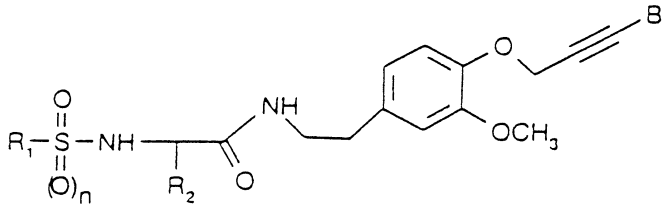


2 克 (S) - 2 - (乙基磺醯基 - 胺基) - 3 - 甲基 - 丁酸 N - [2 - (3 - 甲氧基 - 4 - 炔丙基氧基 - 苯基) - 乙基] - 醯胺，2.1 克 2 - 碘噻吩及 2 毫升三乙胺於 50 毫升氯仿中加熱至 40℃。加入 70 毫克雙 (三苯基膦) 氯化鉀 (I I) 及 32 毫克碘化亞銅 (I)。該反應混合物在 60℃ 攪拌一小時。經由蒸發進行濃縮至乾燥。該殘餘物於具有醋酸乙酯 / 正己烷 (2 : 1) 之矽膠上進行層析且產生之物質，(S) - 2 - (乙基磺醯基 - 胺基) - 3 - 甲基 - 丁酸 N - [2 - { 3 - 甲氧基 - 4 - (3 - (2 - 噻吩基) - 2 - 炔丙 - 1 - 基氧基) - 苯基 } - 乙基] - 醯胺，其自醋酸乙酯 / 正己烷中再結晶，熔點 154 - 155℃。(相等於化合物編號 1.105)

列於表 3 之實施例以類似的方法製備。

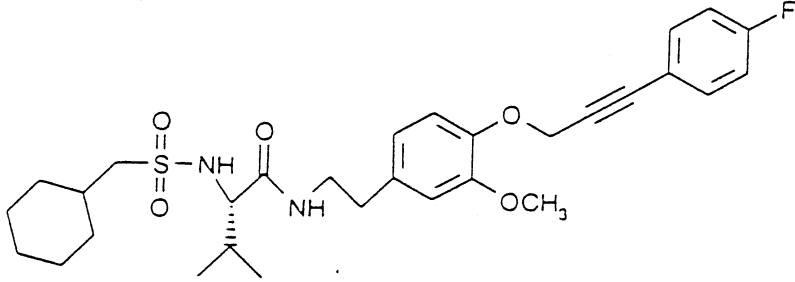
五、發明說明 (51)

表 3



化合物編號	R ₁	n	R ₂	構型	B	物理數據	相同化合物編號
				α -C		熔點°C	
3.001	乙基	1	2-丙基	S	2-噻吩基	154-155	1.105
3.002	乙基	1	2-丙基	S	4-甲氧基-苯基	72-75	1.037

實施例 4.001: (S)-2-(環己基磺醯基-胺基)-3-甲基-丁酸 N-[2-{3-甲氧基-4-(3-(4-氟苯基)-2-炔丙-1-基氧基)-苯基}-乙基]-醯胺 (方法 b))



在室溫下，逐滴加入於丙酮中之飽和過錳酸鉀溶液至於 25 毫升丙酮中之 0.9 克 (S)-2-(環己基亞磺醯基-胺基)-3-甲基-丁酸 N-[2-{3-甲氧基-4-(3-(4-氟苯基)-2-炔丙-1-基氧基)-苯基}-乙基]-醯胺 (化合物 2.008)，直到觀察到反應混合物之持久紫色反應。經由矽藻土進行過濾，接著以丙酮洗滌。該濾液被濃縮至乾燥，產生樹脂形式之 (S)-2-(環己基磺醯基-胺基)-3-甲基-丁酸 N-[2-{3-甲氧基-4-(3-(4-氟苯基)-2-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

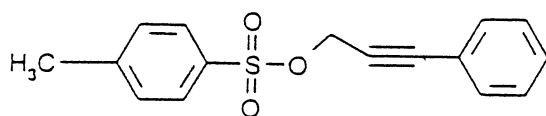
訂
線

五、發明說明(52)

炔丙-1-基氧基)-苯基}-乙基)-醯胺(相等於化合物1.235)，其在具有醋酸乙酯/正己烷之矽膠上進行層析純化。

中間物之製備實施例：

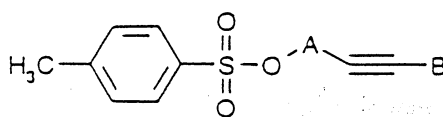
實施例5.001：甲苯-4-磺酸(3-苯基-2-炔丙-1-基)酯



25克3-苯基-2-炔丙-1-醇及40克甲苯-4-磺酸氯化物溶解於500毫升二乙醚中且冷卻至-20℃。26.6克氫氧化鉀細粉末分成數份加入該溶液中，持續20分鐘，此方法其反應混合物之內部溫度不超過-5℃。當添加完成時，自0至5℃攪拌該反應混合物2小時且然後導入1升之冰水。每一次使用1升二乙醚進行萃取兩次。該有機相以500毫升飽和氯化鈉溶液洗滌一次，組合，以硫酸鈉乾燥及濃縮，產生無色樹脂形式之甲苯-4-磺酸(3-苯基-2-炔丙-1-基)酯。

列於表5之實施例以類似前述實施例的方法獲得。

表5



五、發明說明(5)

化合物編號	A	B	物理數據
5.001	-CH ₂ -	苯基	樹脂
5.002	-CH(CH ₃)-	苯基	
5.003	-C(CH ₃) ₂ -	苯基	
5.004	-CH ₂ -	4-氟-苯基	71-72
5.005	-CH ₂ -	4-氯-苯基	油
5.006	-CH ₂ -	4-溴-苯基	68-69
5.007	-CH ₂ -	4-甲氧基-苯基	
5.008	-CH ₂ -	4-NO ₂ -苯基	109-112
5.009	-CH ₂ -	4-MeOOC-苯基	75-77
5.010	-CH ₂ -	4-CF ₃ -苯基	80-81
5.011	-CH ₂ -	4-CF ₃ O-苯基	
5.012	-CH ₂ -	4-CH ₃ CO-苯基	84-86
5.013	-CH ₂ -	4-CN-苯基	
5.014	-CH ₂ -	4-(第三丁基)-苯基	
5.015	-CH ₂ -	4-乙基-苯基	
5.016	-CH ₂ -	4-CHF ₂ O-苯基	
5.017	-CH ₂ -	4-PhCO-苯基	
5.018	-CH ₂ -	4-NH ₂ -苯基	
5.019	-CH ₂ -	4-MeS-苯基	
5.020	-CH ₂ -	3-溴-苯基	59-61
5.021	-CH ₂ -	3-氟-苯基	42-43
5.022	-CH ₂ -	3-氯-苯基	60-62
5.023	-CH ₂ -	3-甲氧基-苯基	58-59
5.024	-CH ₂ -	3-CF ₃ -苯基	油
5.025	-CH ₂ -	3-甲基-苯基	65-66
5.026	-CH ₂ -	3-NO ₂ -苯基	98-99
5.027	-CH ₂ -	3-NH ₂ -苯基	
5.028	-CH ₂ -	3-EtOOC-苯基	
5.029	-CH ₂ -	3-MeOOC-苯基	
5.030	-CH ₂ -	3-CN-苯基	
5.031	-CH ₂ -	2-溴-苯基	72-73
5.032	-CH ₂ -	2-氟-苯基	
5.033	-CH ₂ -	2-氯-苯基	82-85

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂線

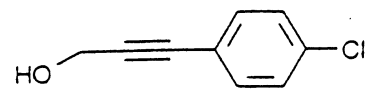
五、發明說明 (54)

5.034	-CH ₂ -	2-甲氧基-苯基	
5.035	-CH ₂ -	2-CF ₃ -苯基	40-42
5.036	-CH ₂ -	2-甲基-苯基	75-77
5.037	-CH ₂ -	2-NO ₂ -苯基	
5.038	-CH ₂ -	2-CF ₃ O-苯基	
5.039	-CH ₂ -	2-MeS-苯基	
5.040	-CH ₂ -	3,4-二-氟-苯基	油
5.041	-CH ₂ -	3,4-二-氯-苯基	63-65
5.042	-CH ₂ -	3,4-二-甲基-苯基	74-77
5.043	-CH ₂ -	3-氟-4-甲基-苯基	
5.044	-CH ₂ -	3-甲基-4-氟-苯基	
5.045	-CH ₂ -	3-氯-4-甲基-苯基	62-64
5.046	-CH ₂ -	3-氟-4-氯-苯基	油
5.047	-CH ₂ -	3-氟-4-溴-苯基	
5.048	-CH ₂ -	3-甲基-4-溴-苯基	
5.049	-CH ₂ -	3-甲基-4-氟-苯基	
5.050	-CH ₂ -	2,4-二-氯-苯基	91-92
5.051	-CH ₂ -	2-氟-4-溴-苯基	
5.052	-CH ₂ -	2,4-二-甲基-苯基	55-57
5.053	-CH ₂ -	2-氯-4-CF ₃ -苯基	
5.054	-CH ₂ -	2-CF ₃ -4-氯-苯基	
5.055	-CH ₂ -	2,4-二-甲氧基-苯基	
5.056	-CH ₂ -	2,5-二-氯-苯基	90-91
5.057	-CH ₂ -	2-氯-5-CF ₃ -苯基	76-77
5.058	-CH ₂ -	2,5-二-甲基-苯基	
5.059	-CH ₂ -	2-甲氧基-5-氯-苯基	
5.060	-CH ₂ -	2-甲氧基-5-MeOOC-苯基	
5.061	-CH ₂ -	2-甲基-5-氯-苯基	
5.062	-CH ₂ -	3,5-二-氯-苯基	64-66
5.063	-CH ₂ -	3-氟-5-NO ₂ -苯基	
5.064	-CH ₂ -	3,5-二-CF ₃ -苯基	油
5.065	-CH ₂ -	3,5-二-甲基-苯基	
5.066	-CH ₂ -	2,4,5-三-氯-苯基	95-96
5.067	-CH ₂ -	2,3,4,5,6-五-氟-苯基	
5.068	-CH ₂ -	2-吡啶基	
5.069	-CH ₂ -	6-甲基-2-吡啶基	

五、發明說明 (55)

5.070	-CH ₂ -	3-氯-5-CF ₃ -2-吡啶基	
5.071	-CH ₂ -	5-CF ₃ -吡啶基	
5.072	-CH ₂ -	3-吡啶基	
5.073	-CH ₂ -	4-吡啶基	
5.074	-CH ₂ -	2-嘧啶基	
5.075	-CH ₂ -	4-吡唑基	
5.076	-CH ₂ -	2-噻吩基	
5.077	-CH ₂ -	5-甲基-2-噻吩基	
5.078	-CH ₂ -	2,4,5-三-甲基-噻吩基	
5.079	-CH ₂ -	2-苯並噻唑基	
5.080	-CH ₂ -	2-喹啉基	
5.081	-CH ₂ -	2-甲基-苯基	55-57
5.082	-CH ₂ -	2-MeOOC-苯基	59-61
5.083	-CH ₂ -	2,4-二-氟-苯基	油
5.084	-CH ₂ -	1-萘基	油
5.085	-CH ₂ -	4-氟-3-甲基-苯基	38-40
5.086	-CH ₂ -	3-氯-4-氟-苯基	53-55
5.087	-CH ₂ -	丁基	油

實施例 6 . 0 0 1 : 3 - (4 - 氯 - 苯基) - 2 - 炔丙
- 1 - 醇



6 克 1 - 氯 - 4 - 碘基 - 苯 , 1 . 8 毫升丙炔醇及於 3
0 毫升氯仿中之 5 . 2 毫升三乙胺之混合物至於氮氣下。加
入 2 0 8 毫克雙 (三苯基膦) 二氯化鈣 (I I) 及 9 8 毫
克碘化亞銅 (I) 。該反應混合物於 4 0 ° C 中攪拌一小時

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

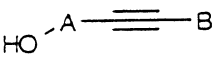
訂
線

五、發明說明 (56)

。然後加入 3 0 0 毫升熱正己烷。傾出該正己烷相。該殘餘物再一次以 2 0 0 毫升熱正己烷溶解，且傾出該正己烷相。濃縮該正己烷相且該殘餘物於具有醋酸乙酯／正己烷（1：4）之矽膠上進行急驟層析，產生 3 - （4 - 氯 - 苯基） - 2 - 炔丙 - 1 - 醇，其可自正己烷中再結晶，熔點 7 8 - 8 0 °C。

列於表 6 之實施例以類似前述實施例的方法獲得。

表 6



化合物編號	A	B	物理數據，熔點°C
6.001	-CH ₂ -	4-氯-苯基	78-80
6.002	-CH(CH ₃)-	苯基	
6.003	-CH ₂ -	苯基	
6.004	-CH ₂ -	4-氟-苯基	油
6.005	-CH ₂ -	4-溴-苯基	80-81
6.006	-CH ₂ -	4-甲氧基-苯基	
6.007	-CH ₂ -	4-NO ₂ -苯基	95-97
6.008	-CH ₂ -	4-MeOOC-苯基	73-75
6.009	-CH ₂ -	4-CF ₃ -苯基	40-41
6.010	-CH ₂ -	4-CF ₃ O-苯基	
6.011	-CH ₂ -	4-CH ₃ CO-苯基	77-80
6.012	-CH ₂ -	4-CN-苯基	
6.013	-CH ₂ -	4-(第三丁基)-苯基	
6.014	-CH ₂ -	4-乙基-苯基	
6.015	-CH ₂ -	4-CHF ₂ O-苯基	
6.016	-CH ₂ -	4-PhCO-苯基	
6.017	-CH ₂ -	4-NH ₂ -苯基	

五、發明說明 (5')

6.018	-CH ₂ -	4-MeS-苯基	
6.019	-CH ₂ -	3-溴-苯基	24-27
6.020	-CH ₂ -	3-氟-苯基	油
6.021	-CH ₂ -	3-氯-苯基	油
6.022	-CH ₂ -	3-甲氧基-苯基	油
6.023	-CH ₂ -	3-CF ₃ -苯基	油
6.024	-CH ₂ -	3-甲基-苯基	油
6.025	-CH ₂ -	3-NO ₂ -苯基	油
6.026	-CH ₂ -	3-NH ₂ -苯基	
6.027	-CH ₂ -	3-EtOOC-苯基	
6.028	-CH ₂ -	3-MeOOC-苯基	
6.029	-CH ₂ -	3-CN-苯基	
6.030	-CH ₂ -	2-溴-苯基	油
6.031	-CH ₂ -	2-氟-苯基	
6.032	-CH ₂ -	2-氯-苯基	油
6.033	-CH ₂ -	2-甲氧基-苯基	
6.034	-CH ₂ -	2-CF ₃ -苯基	油
6.035	-CH ₂ -	2-甲基-苯基	油
6.036	-CH ₂ -	2-NO ₂ -苯基	
6.037	-CH ₂ -	2-CF ₃ O-苯基	
6.038	-CH ₂ -	2-MeS-苯基	
6.039	-CH ₂ -	3,4-二-氟-苯基	油
6.040	-CH ₂ -	3,4-二-氯-苯基	62-63
6.041	-CH ₂ -	3,4-二-甲基-苯基	油
6.042	-CH ₂ -	3-氟-4-甲基-苯基	
6.043	-CH ₂ -	3-甲基-4-氟-苯基	
6.044	-CH ₂ -	3-氯-4-甲基-苯基	25-27
6.045	-CH ₂ -	3-氟-4-氯-苯基	38-41
6.046	-CH ₂ -	3-氟-4-溴-苯基	
6.047	-CH ₂ -	3-甲基-4-溴-苯基	
6.048	-CH ₂ -	3-甲基-4-氟-苯基	
6.049	-CH ₂ -	2,4-二-氯-苯基	79-81
6.050	-CH ₂ -	2-氟-4-溴-苯基	
6.051	-CH ₂ -	2,4-二-甲基-苯基	油
6.052	-CH ₂ -	2-氯-4-CF ₃ -苯基	
6.053	-CH ₂ -	2-CF ₃ -4-氯-苯基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明 (58)

6.054	-CH ₂ -	2,4-二-甲氧基-苯基	
6.055	-CH ₂ -	2,5-二-氯-苯基	81-82
6.056	-CH ₂ -	2-氯-5-CF ₃ -苯基	油
6.057	-CH ₂ -	2,5-二-甲基-苯基	
6.058	-CH ₂ -	2-甲氧基-5-氯-苯基	
6.059	-CH ₂ -	2-甲氧基-5-MeOOC-苯基	
6.060	-CH ₂ -	2-甲基-5-氯-苯基	
6.061	-CH ₂ -	3,5-二-氯-苯基	65-67
6.062	-CH ₂ -	3-氟-5-NO ₂ -苯基	
6.063	-CH ₂ -	3,5-二-CF ₃ -苯基	
6.064	-CH ₂ -	2,4,5-三-氯-苯基	127-130
6.065	-CH ₂ -	2,3,4,5,6-五-氟-苯基	
6.066	-CH ₂ -	2-吡啶基	
6.067	-CH ₂ -	6-甲基-2-吡啶基	
6.068	-CH ₂ -	3-氯-5-CF ₃ -2-吡啶基	
6.069	-CH ₂ -	5-CF ₃ -吡啶基	
6.070	-CH ₂ -	3-吡啶基	
6.071	-CH ₂ -	4-吡啶基	
6.072	-CH ₂ -	2-嘧啶基	
6.073	-CH ₂ -	4-吡嗪基	
6.074	-CH ₂ -	2-噻吩基	
6.075	-CH ₂ -	5-甲基-2-噻吩基	
6.076	-CH ₂ -	2,4,5-三-甲基-噻吩基	
6.077	-CH ₂ -	2-苯並噻唑基	
6.078	-CH ₂ -	2-喹啉基	
6.079	-CH ₂ -	4-甲基-苯基	油
6.080	-CH ₂ -	2-MeOOC-苯基	油
6.081	-CH ₂ -	2,4-二-氟-苯基	油
6.082	-CH ₂ -	1-萘基	油
6.083	-CH ₂ -	4-氟-3-甲基-苯基	27-30
6.084	-CH ₂ -	3-氯-4-氟-苯基	29-32

配方可用類似於那些，例如，描述於 W O 9 5 / 3
0 6 5 1 中方法而被製備。

生物實施例

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

五、發明說明(59)

B 1：抗葡萄樹上之葡萄生單軸黴 (*Plasmopara viticola*) 之作用

a) 殘留－保護作用

將 4－至 5－葉期之葡萄苗木以製備自試驗化合物之可溼性粉末配方之噴灑混合物 (0.02% 活性成分) 噴灑。在 24 小時後，該處理過之植物以真菌孢子囊懸浮液感染。在於相對溼度 95－100% 及 20℃ 培養 6 天後，進行真菌感染評估。

b) 殘留－治療作用

將 4－至 5－葉期之葡萄苗木以真菌孢子囊懸浮液感染。在被保持於相對溼度 95－100% 及 20℃ 之溼度室培養 24 小時後，該被感染植物被烘乾且噴灑製備自試驗化合物之可溼性粉末配方之噴灑混合物 (0.02% 活性成分)。在噴霧包膜乾燥後，該經處理之植物再被至於溼度室中。在感染 6 天後，進行真菌感染評估。

表 1 之化合物顯示非常良好之抗葡萄樹上之葡萄生單軸黴 (*Plasmopara viticola*) 之殺真菌作用。化合物 1.001, 1.003, 1.010, 1.033, 1.034, 1.035, 1.036, 1.037, 1.038, 1.039, 1.040, 1.042, 1.050, 1.051, 1.052, 1.053, 1.054, 1.055, 1.056, 1.061, 1.063, 1.065, 1.066, 1.070, 1.071, 1.072, 1.073, 1.075, 1.076, 1.080, 1.082, 1.086, 1.0

五、發明說明(60)

87, 1.091, 1.093, 1.095, 1.105, 1.128, 1.129, 1.136, 1.204, 1.207, 1.210, 1.219, 1.243, 1.249, 1.255, 1.258, 1.261, 1.264, 1.270, 1.271, 1.282, 1.284及1.285, 達到完全抑制真菌感染(殘留感染0至5%)。另一方面, 在未經處理及經感染之控制組植物之葡萄生單軸黴侵襲為100%。

B2: 抗蕃茄上之致病疫黴(*Phytophthora*)之作用

a) 殘留－保護作用

於栽培三週後, 蕃茄植物被噴灑製備自試驗化合物之可溼性粉末配方之噴灑混合物(0.02%活性成分)。在48小時後, 該處理過之植物以真菌孢子囊懸浮液感染。在該經感染之植物於相對溼度90-100%及20℃培養5天後, 進行真菌感染評估。

b) 系統作用

於栽培三週後, 蕃茄植物被以製備自試驗化合物之可溼性粉末配方之噴灑混合物(基於土壤之體積0.02%活性成分)灑水。注意該噴灑混合物並沒有接觸到在地面上之植物的部份。在96小時後, 該處理過之植物以真菌孢子囊懸浮液感染。在該經感染之植物於相對溼度90-100%及20℃培養4天後, 進行真菌感染評估。

表1之化合物顯示持續效果(少於20%之真菌感染)。以化合物編號1.001, 1.003, 1.010, 1

五、發明說明(6)

.033, 1.034, 1.035, 1.036, 1.037, 1.038, 1.039, 1.040, 1.042, 1.050, 1.051, 1.052, 1.053, 1.054, 1.055, 1.056, 1.061, 1.063, 1.065, 1.066, 1.070, 1.071, 1.072, 1.073, 1.075, 1.076, 1.080, 1.082, 1.086, 1.087, 1.091, 1.093, 1.095, 1.105, 1.128, 1.129, 1.136, 1.204, 1.207, 1.210, 1.219, 1.243, 1.249, 1.255, 1.258, 1.261, 1.264, 1.270, 1.271, 1.282, 1.284 及 1.285, 感染被幾乎完全阻止(0至5%感染)。另一方面, 在未經處理及經感染之控制組植物之致病疫黴侵襲為100%。

實施例 B 3 : 抗馬鈴薯上之致病疫黴 (*Phytophthora*) 之作用

a) 殘留—保護作用

2—3 週大之馬鈴薯 (Bintje variety) 被噴灑製備自試驗化合物之可溼性粉末配方之噴灑混合物 (0.02% 活性成分)。在 48 小時後, 該處理過之植物以真菌孢子囊懸浮液感染。在該經感染之植物於相對溼度 90—100% 及 20℃ 培養 4 天後, 進行真菌感染評估。

b) 系統作用

2—3 週大之馬鈴薯 (Bintje variety) 被以製備自

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂線

五、發明說明 (6)

試驗化合物之可溼性粉末配方之噴灑混合物（基於土壤之體積 0.02 % 活性成分）灑水。注意該噴灑混合物並沒有接觸到在地面上之植物的部份。在 48 小時後，該處理過之植物以真菌孢子囊懸浮液感染。在該經感染之植物於相對溼度 90 – 100 % 及 20 °C 培養 4 天後，進行真菌感染評估。

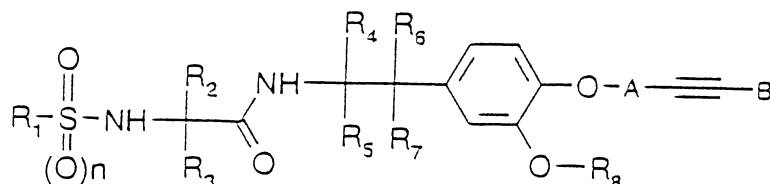
以表 1 化合物（例如，1.001，1.003，1.010，1.033，1.034，1.035，1.036，1.037，1.038，1.039，1.040，1.042，1.050，1.051，1.052，1.053，1.054，1.055，1.056，1.061，1.063，1.065，1.066，1.070，1.071，1.072，1.073，1.075，1.076，1.080，1.082，1.086，1.087，1.091，1.093，1.095，1.105，1.128，1.129，1.136，1.204，1.207，1.210，1.219，1.243，1.249，1.255，1.258，1.261，1.264，1.270，1.271，1.282，1.284 及 1.285），感染被幾乎完全阻止（0 至 5 % 感染）。另一方面，在未經處理及經感染之控制組植物之致病疫黴侵襲為 100 %。

四、中文發明摘要（發明之名稱：

)

殺微生物之 N - 磺醯基甘氨酸炔基氧基苯乙基醯胺衍生物

本發明係關於通式 I 之新穎除害活性化合物，



其中

n 為數字 0 或 1；

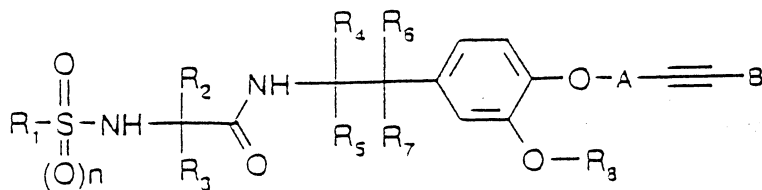
R₁ 為 C₁ - C₆ 烷基，其為未取代的或可經 C₃ - C₈ 環烷基所取代；C₃ - C₈ 環烷基；C₂ - C₆ 烯基；C₁ -

英文發明摘要（發明之名稱：

)

MICROBICIDAL N-SULFONYLGLYCIN ALKYNXYLOXYPHENETHYL AMIDE
DERIVATIVES

The invention relates to novel pesticidally active compounds of the general formula I



wherein

n is a number zero or one;

R₁ is C₁-C₆alkyl that is unsubstituted or may be substituted by C₃-C₈cycloalkyl; C₃-C₈cycloalkyl; C₂-C₆alkenyl; C₁-C₆haloalkyl; or a group NR₁₁R₁₂ wherein R₁₁ and R₁₂ are each independently of the other hydrogen or C₁-C₄alkyl, or together are tetra- or penta-methylene;

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄）

訂

線

四、中文發明摘要（發明之名稱：_____）

C₆ 鹵烷基；或 N R₁₁ R₁₂ 基團，其中 R₁₁ 及 R₁₂ 為各自獨立為氫或 C₁ - C₄ 烷基，或一起為丁撐或戊撐；

R₂ 及 R₃ 各自獨立為氫或 C₁ - C₆ 烷基；

R₄，R₅，R₆ 及 R₇ 為相同的或相異的且個別獨立為氫或 C₁ - C₄ 烷基；

R₈ 為 C₁ - C₆ 烷基；

A 為 C₁ - C₆ 烷撐；且

B 為苯基；萘基；或噻吩基，其每一個可選擇地以鹵素，C₁ - C₆ 烷基，C₁ - C₆ 烷氧基，C₁ - C₈ 鹵烷基或 C₁ - C₆ 烷氧基羰基取代；或為 C₄ - C₈ 烷基。

該新穎化合物具有保護植物性質且適合作為保護植物

英文發明摘要（發明之名稱：_____）

R₂ and R₃ are each independently of the other hydrogen or C₁-C₆alkyl;

R₄, R₅, R₆ and R₇ are identical or different and are each independently of the others hydrogen or C₁-C₄alkyl;

R₈ is C₁-C₆alkyl;

A is C₁-C₆alkylene; and

B is phenyl; naphthyl; or thienyl, each optionally substituted with halogen, C₁-C₆alkyl, C₁-C₆alkoxy, C₁-C₈haloalkyl or C₁-C₆alkoxycarbonyl; or is C₄-C₈alkyl.

The novel compounds have plant-protecting properties and are suitable for protecting plants against infestation by phytopathogenic microorganisms.

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄）

訂

線

四、中文發明摘要（發明之名稱：_____）

對抗植物病原性微生物之侵襲。

英文發明摘要（發明之名稱：_____）

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄）

裝訂

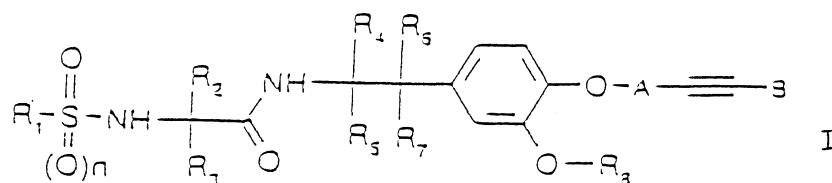
訂

線

六、申請專利範圍

9173028

1、一種式 I 化合物，



其中

n 為數字 0 或 1；

R₁ 為 C₁ - C₆ 烷基，其為未取代的或可經 C₃ - C₈ 環烷基所取代；C₃ - C₈ 環烷基；C₂ - C₆ 烯基；C₁ - C₆ 鹵烷基；或 N R₁₁ R₁₂ 基團，其中 R₁₁ 及 R₁₂ 為各自獨立為氫或 C₁ - C₄ 烷基，或一起為丁撐或戊撐；

R₂ 及 R₃ 各自獨立為氫或 C₁ - C₆ 烷基；

R₄，R₅，R₆ 及 R₇ 為相同的或相異的且個別獨立為氫或 C₁ - C₄ 烷基；

R₈ 為 C₁ - C₆ 烷基；A 為 C₁ - C₆ 烷撐；且

B 為苯基；萘基；或噻吩基，其每一個可選擇地以鹵素，C₁ - C₆ 烷基，C₁ - C₆ 烷氧基，C₁ - C₈ 鹵烷基或 C₁ - C₆ 烷氧基羰基取代；或為 C₄ - C₈ 烷基。

2、根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，其中

n 為數字 1；

R₁ 為 C₁ - C₆ 烷基；C₁ - C₆ 鹵烷基；或 N R₁₁ R₁₂ 基團，其中 R₁₁ 及 R₁₂ 為各自獨立為 C₁ - C₄ 烷基；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

六、申請專利範圍

R_3 為 $C_3 - C_4$ 烷基；

R_4 為氫或甲基；

R_8 為 $C_1 - C_2$ 烷基；

A 為甲撐；且

B 為苯基，萘基或噻吩基，其每一個為未取代的或經由自 1 至 3 個取代基所取代，該取代基係選擇自： $C_1 - C_6$ 烷基， $C_1 - C_8$ 烷氧基， $C_1 - C_8$ 鹵烷基及 $C_1 - C_6$ 烷氧基羰基。

3、根據申請專利範圍第 2 項之式 I 化合物，其中

R_1 為 $C_1 - C_4$ 烷基；或二甲基胺基；

R_3 為 2-丙基；

R_8 為甲基；

B 為苯基，萘基，其每一個為未取代的或經由自 1 至 3 個取代基所取代，該取代基係選擇自： $C_1 - C_6$ 烷基， $C_1 - C_6$ 鹵烷基， $C_1 - C_6$ 烷氧基及 $C_1 - C_6$ 烷氧基羰基。

4、根據申請專利範圍第 2 項之式 I 化合物，其中

R_1 為 $C_1 - C_4$ 烷基；或二甲基胺基；

R_3 為 2-丙基；

R_8 為甲基；

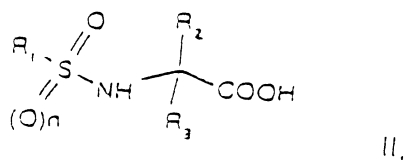
B 為噻吩基，其為未取代的或經由自 1 至 3 個取代基所取代，該取代基係選擇自： $C_1 - C_6$ 烷基， $C_1 - C_6$ 鹵烷基， $C_1 - C_6$ 烷氧基及 $C_1 - C_6$ 烷氧基羰基。

5、一種製備根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物

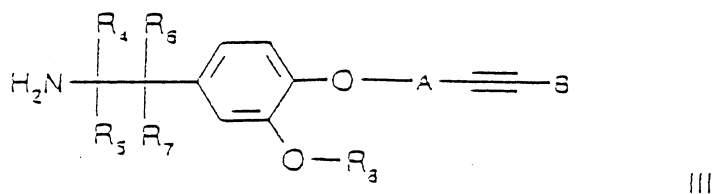
六、申請專利範圍

之方法，其包括

a) 經由將式 I I 之經取代的胺基酸

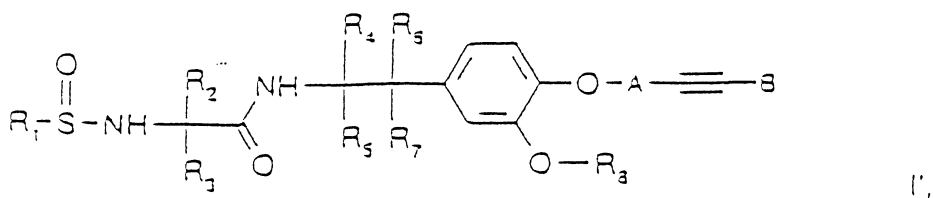


其中 R_1 ， R_2 及 R_3 基及 n 為如申請專利範圍第 1 項中所定義，或其羧基活化衍生物，若需要，在催化劑的存在下，若需要，在酸性結合劑存在下及若需要，在稀釋劑存在下，於溫度自 -80 至 $+150^\circ\text{C}$ ，與式 I I I 之胺反應



其中 R_4 ， R_5 ， R_6 ， R_7 ， R_8 ，A 及 B 為如申請專利範圍第 1 項中所定義；或

b) 經由將式 I' 化合物

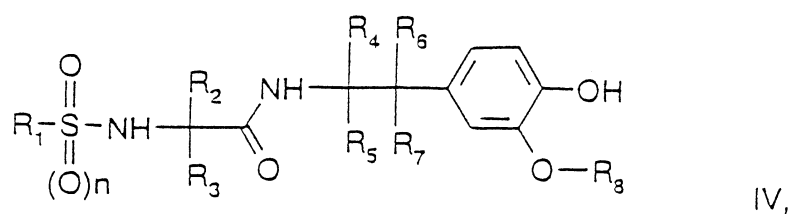


其中 R_1 ， R_2 ， R_3 ， R_4 ， R_5 ， R_6 ， R_7 ， R_8 ，

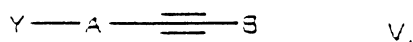
六、申請專利範圍

A 及 B 如申請專利範圍第 1 項中所定義，其條件是取代基 R_1 ， R_2 ， R_3 及 B 無包含硫醇或烷基硫醇基團，與氧化劑於惰性稀釋劑中，若需要，於酸之存在下或，若需要，於鹼之存在下，自 -80 至 $+150^\circ\text{C}$ 之溫度中進行氧化；或

c) 經由將式 I V



其中 R_1 ， R_2 ， R_3 ， R_4 ， R_5 ， R_6 ， R_7 ， R_8 及 n 為如申請專利範圍第 1 項中所定義，與式 V 之化合物

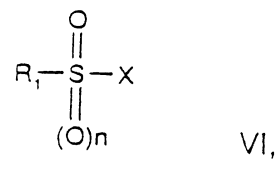


其中 A 及 B 為如申請專利範圍第 1 項中所定義且其中 Y 為一離去基團，於惰性稀釋劑中，若需要，在酸性結合劑的存在下，溫度為自 -80 至 $+200^\circ\text{C}$ 下進行反應；或

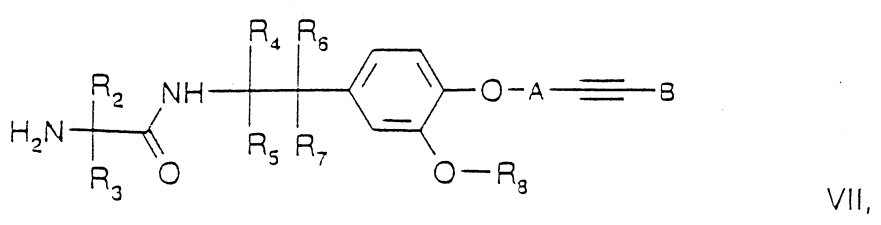
d) 經由將式 V I 之磺酸或亞磺酸，或磺酸或亞磺酸衍生物

A8
B8
C8
D8

六、申請專利範圍

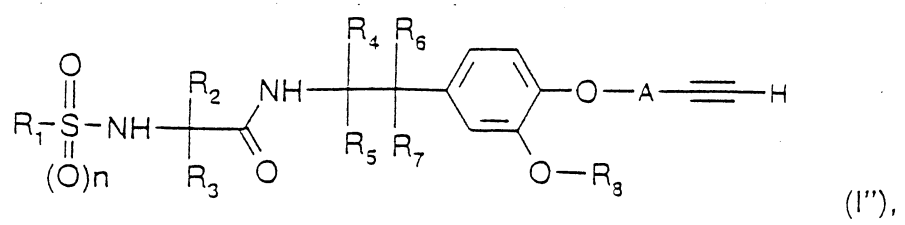


其中個別地 R₁ 及 n 為如申請專利範圍第 1 項中所定義且其中 X 個別地為 OH 基團或離去基團，與式 VII 之胺類



其中，R₂，R₃，R₄，R₅，R₆，R₇，R₈，A 及 B 為如申請專利範圍第 1 項中所定義，於惰性稀釋劑中，若需要，在酸性結合劑的存在下，溫度為自 -80 至 +150 °C 中進行反應；或

e) 經由將式 I'' 之炔類



其中 R₁，R₂，R₃，R₄，R₅，R₆，R₇，R₈，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

六、申請專利範圍

A 及 n 為如申請專利範圍第 1 項中所定義，與一芳基鹵化物或雜芳基鹵化物於惰性稀釋劑中，若需要，在一種或多種過渡金屬鹽類之存在下且若需要，在一種或多種過渡金屬複合物或過渡金屬複合物鹽類之存在下，溫度為自 -80 至 $+200^{\circ}\text{C}$ 下進行反應。

6、一種控制及保護對抗植物病原性微生物之組成物，其包括根據申請專利範圍第 1 項之化合物作為活性成分以及一適合之載劑。

7、根據申請專利範圍第 6 項之組成物，其包括根據申請專利範圍第 2 至 4 項中任一項之式 I 化合物作為活性成分。

8、根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物，其係用於保護植物對抗植物病原性微生物之侵襲。

9、根據申請專利範圍第 8 項之式 I 化合物，其中根據申請專利範圍第 2 至 4 項中任一項之式 I 化合物被使用作為活性成分。

10、一種控制及防止農作植物被植物病原性微生物侵襲之方法，其包括將根據申請專利範圍第 1 項之式 I 化合物作為活性成分應用至植物上，植物的部份或其所在地。

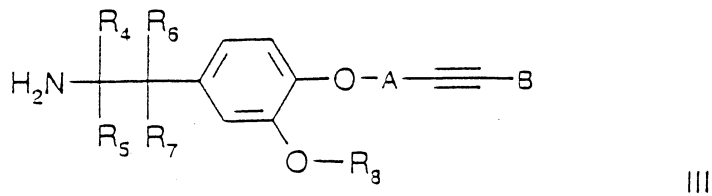
11、根據申請專利範圍第 10 項之方法，其中根據申請專利範圍第 2 至 4 項中任一項之式 I 化合物被應用作為活性成分。

12、根據申請專利範圍第 10 項之方法，其中該植

六、申請專利範圍

物病原性微生物為真菌。

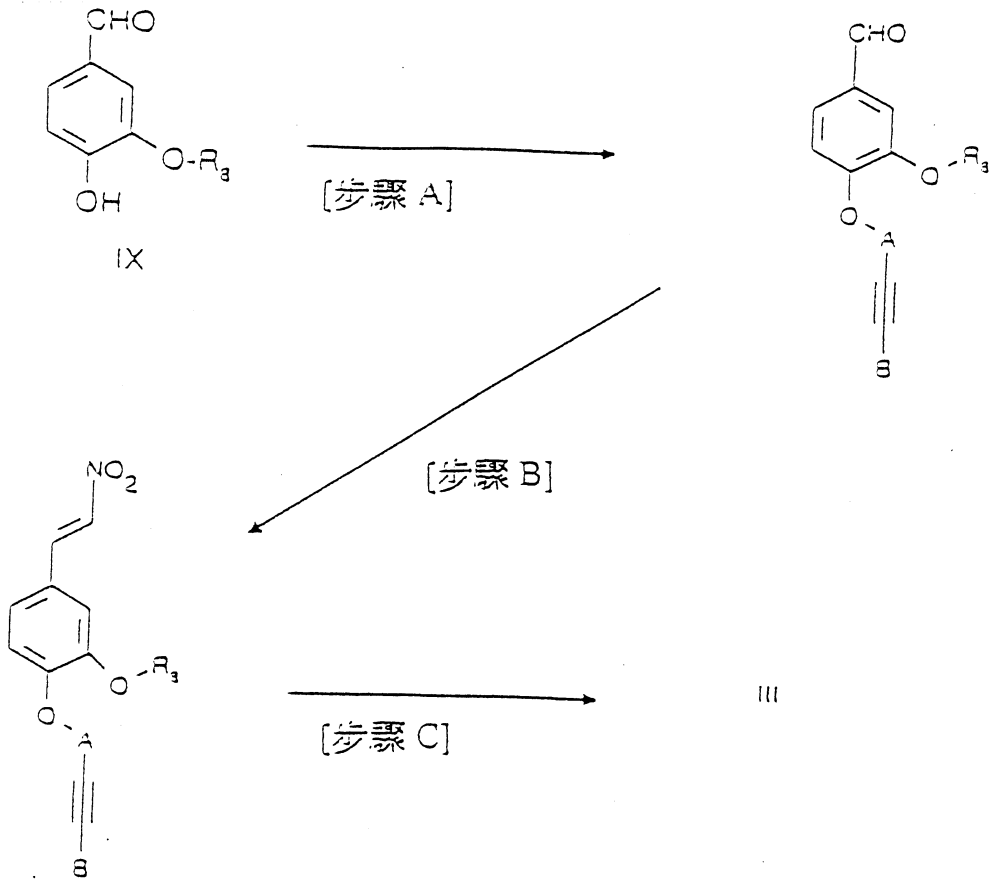
1 3、一種式 I I I 之化合物，



其中 R₄，R₅，R₆，R₇，R₈，A 及 B 為如申請專利範圍第 1 項中所定義。

1 4、一種製備根據申請專利範圍第 1 3 項之式 I I I 化合物之方法，其包括使用

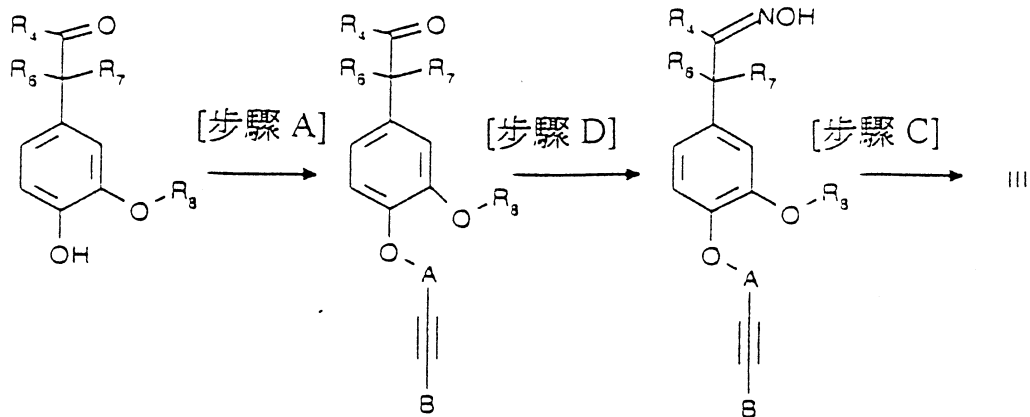
變化方法 1



六、申請專利範圍

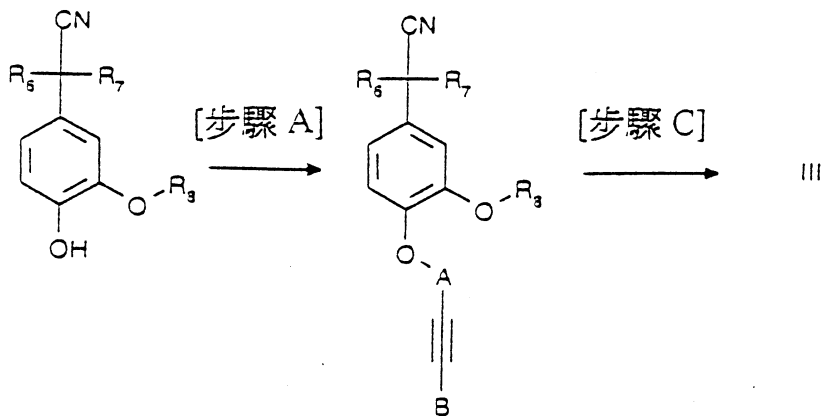
或

變化方法 2



或

變化方法 3



或

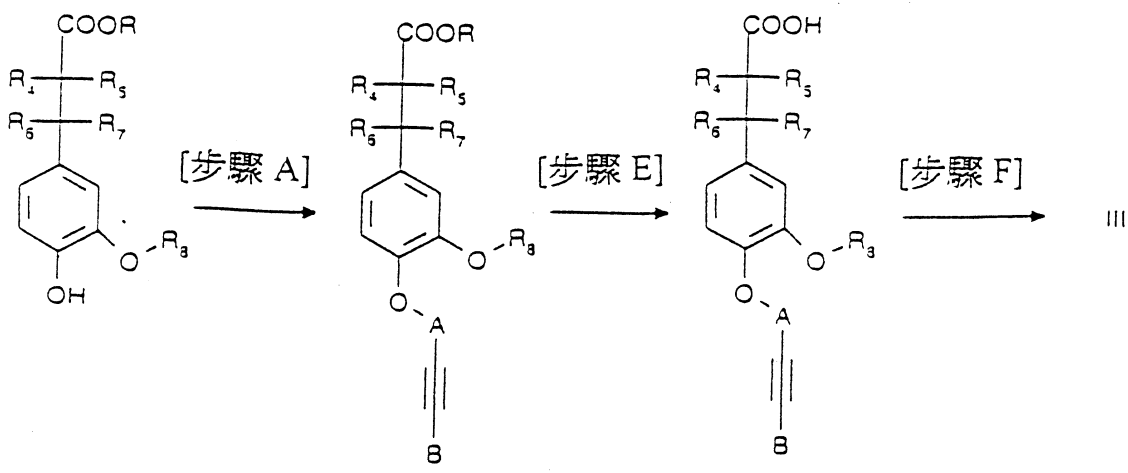
變化方法 4

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

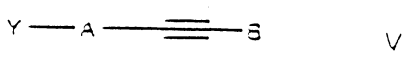
線

六、申請專利範圍



其中

步驟 A 為酚與式 V 化合物之烷化



其中 A 及 B 如申請專利範圍第 1 項中所定義且 Y 為一離去基；

步驟 B 為芳香醛與硝基甲烷之反應；

步驟 C 為不飽和氮化合物之還原；

步驟 D 為醛或酮與羥基胺或羥基胺鹽之反應；

步驟 E 為低級烷基酯類之水解；及

步驟 F 為羧酸或羧酸之活化衍生物與疊氮酸或與該酸之鹽類之反應。

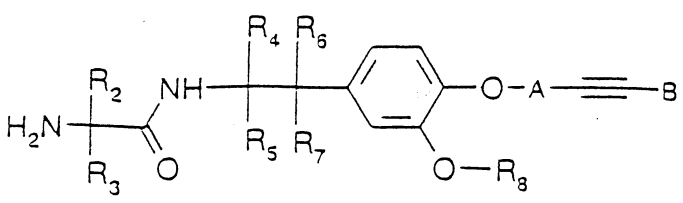
15、一種式 V I I 之化合物，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

總

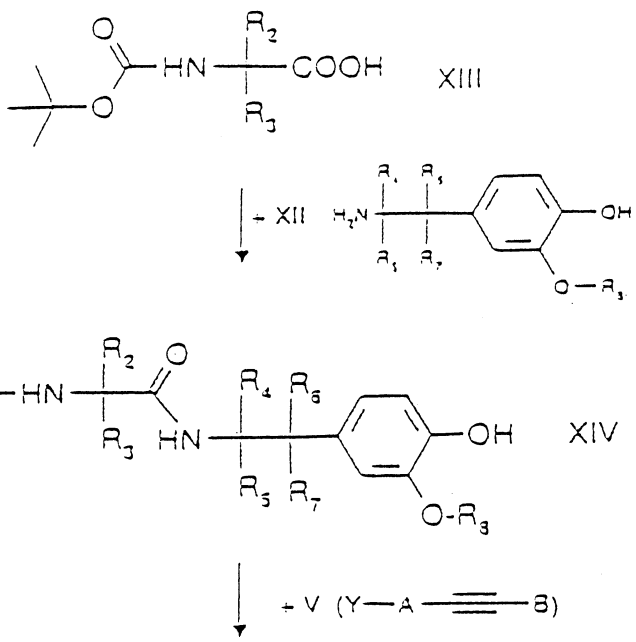
六、申請專利範圍



VII

其中， R_2 ， R_3 ， R_4 ， R_5 ， R_6 ， R_7 ， R_8 ， A 及 B 為如申請專利範圍第 1 項中所定義。

16、一種製備根據申請專利範圍第 15 項之式 V I 化合物之方法，其包括進行下列反應順序



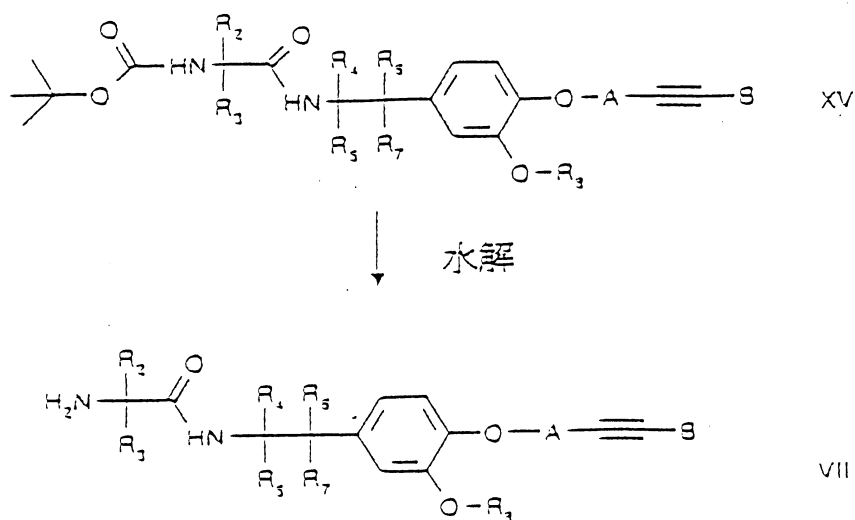
XIV

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

約

六、申請專利範圍



其中

式X I I I之胺基酸衍生物，或其羧基活化衍生物，若需要，在催化劑之存在下，若需要，在一酸性結合劑之存下，且若需要，在稀釋劑之存在下，與式X I I之胺類進行反應；且

式X I V化合物與式V化合物，若需要，在酸性結合劑的存在下且若需要，在惰性稀釋劑之存在下，溫度為自 -80 至 $+200^{\circ}\text{C}$ 下進行反應；且然後

式X V化合物以無機酸或有機酸，若需要，於惰性稀釋劑中，溫度為自 -40 至 $+150^{\circ}\text{C}$ 下進行酸水解。