



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公告本

(11)證書號數：TW I570111 B

(45)公告日：中華民國 106 (2017) 年 02 月 11 日

(21)申請案號：104130403

(22)申請日：中華民國 96 (2007) 年 07 月 26 日

(51)Int. Cl.: C07D261/04 (2006.01)

(30)優先權：2006/07/27 美國 60/833,824

2007/01/24 美國 60/897,173

(71)申請人：杜邦股份有限公司 (美國) E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY (US)
美國(72)發明人：派斯特瑞 羅伯特 詹姆士 PASTERIS, ROBERT JAMES (US)；漢納根 瑪莉
安 HANAGAN, MARY ANN (US)；沙皮羅 拉菲爾 SHAPIRO, RAFAEL (US)

(74)代理人：陳傳岳；郭雨嵐

(56)參考文獻：

WO 2006/032322A1

Wade et al., "Acid-catalyzed nitronate cycloaddition reactions.
Useful Syntheses and simple transformations of 3-Acyl- and 3-
Alkenylisoxazoles." J. Org. Chem. 1984, 49, 4595-4601.

審查人員：魏鳳鳳

申請專利範圍項數：2 項 圖式數：0 共 341 頁

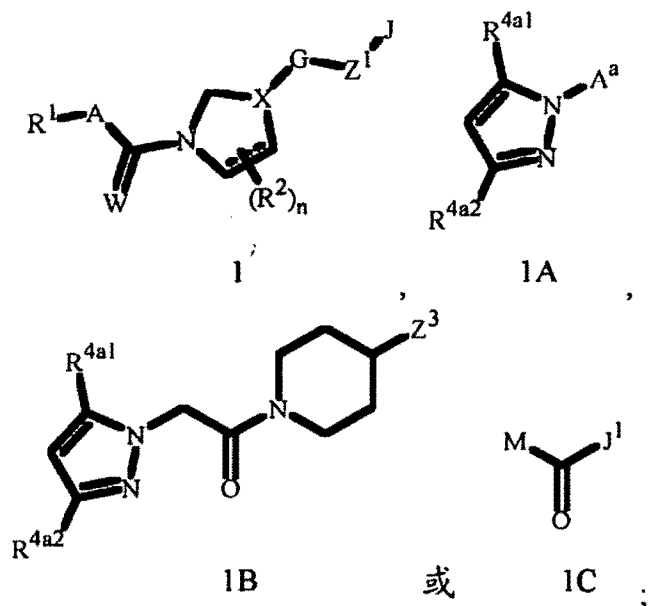
(54)名稱

二氫異唑類化合物

DIHYDROISOXAZOLES

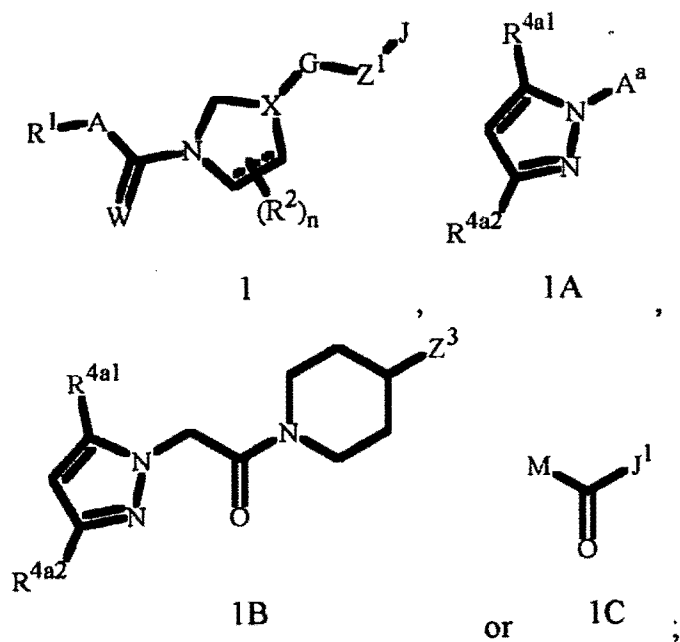
(57)摘要

本發明係揭示式 1、1A、1B 及 1C 化合物，包括其所有幾何與立體異構物、N-氧化物及鹽，

其中 $R^1, R^2, R^{4a1}, R^{4a2}, A, A^a, G, M, W, Z^1, Z^3, X, J, J^1$ 及 n 均如揭示內容中之定義。

本發明亦揭示含有式 1 化合物之組合物，及控制因真菌病原所造成之植物疾病之方法，其包括施用有效量之本發明化合物或組合物。

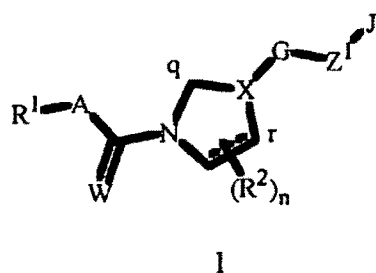
Disclosed are compounds of Formulae 1, 1A, 1B and 1C including all geometric and stereoisomers, N-oxides, and salts thereof,



wherein R^1 , R^2 , R^{4a1} , R^{4a2} , A, A^a , G, M, W, Z^1 , Z^3 , X, J, J^1 and n are as defined in the disclosure.

Also disclosed are compositions containing the compounds of Formula 1 and methods for controlling plant disease caused by a fungal pathogen comprising applying an effective amount of a compound or a composition of the invention.

特徵化學式：



發明摘要

※ 申請案號：104130403 (由 96127297 分割)

※ 申請日：96.7.26

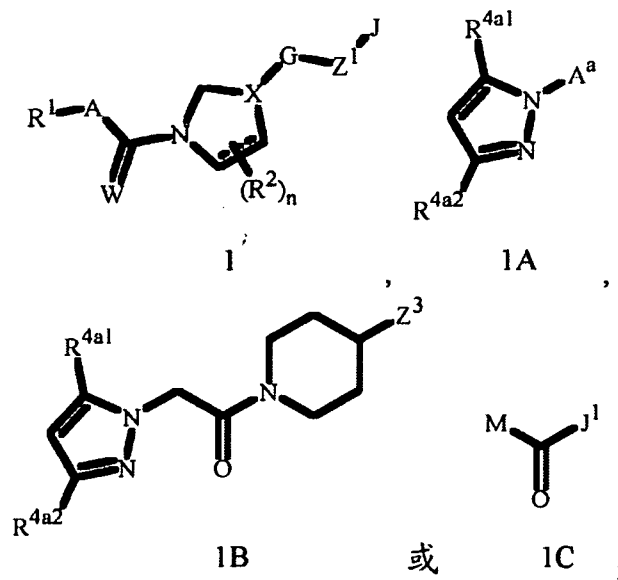
※ IPC 分類：C07D 261/04

5 【發明名稱】(中文/英文)

二氫異唑類化合物/DIHYDROISOXAZOLES

【中文】

本發明係揭示式 1、1A、1B 及 1C 化合物，包括其所有幾何與立體異構物、N-氧化物及鹽，



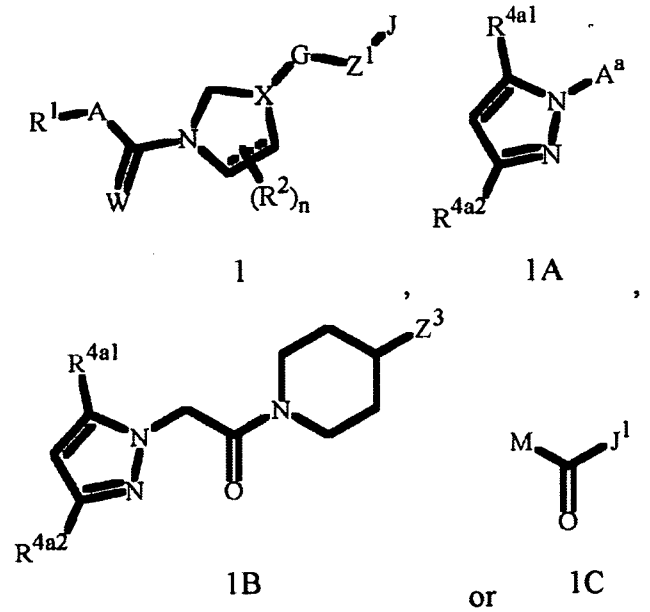
其中

R^1 , R^2 , R^{4a1} , R^{4a2} , A, A^a , G, M, W, Z^1 , Z^3 , X, J, J^1 及 n 均如揭示內容中之定義。

15 本發明亦揭示含有式 1 化合物之組合物，及控制因真菌病原所造成之植物疾病之方法，其包括施用有效量之本發明化合物或組合物。

【英文】

Disclosed are compounds of Formulae 1, 1A, 1B and 1C including all geometric and stereoisomers, N-oxides, and salts thereof,



wherein

R¹, R², R^{4a1}, R^{4a2}, A, A^a, G, M, W, Z¹, Z³, X, J, J¹ and n are as defined in the disclosure.

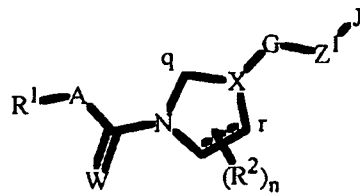
Also disclosed are compositions containing the compounds of Formula 1 and methods for controlling plant disease caused by a fungal pathogen comprising applying an effective amount of a compound or a composition of the invention.

【代表圖】**【本案指定代表圖】：**無**【本代表圖之符號簡單說明】：**無

5

【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】：

10



1

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)

二氫異唑類化合物/DIHYDROISOXAZOLES

5

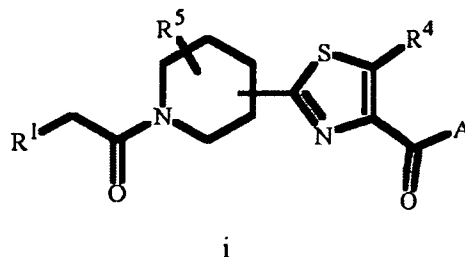
【技術領域】

本發明係關於某些羧醯胺，其N-氧化物，鹽及組合物，及其作為殺真菌劑使用之方法。

【先前技術】

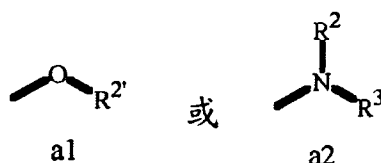
10 因真菌植物病原所造成植物疾病之控制，在達成高農作物效率上係極端地重要。對裝飾、蔬菜、農場、穀類及水果作物之植物疾病傷害，可造成生產率上之顯著降低，且於是對消費者造成增加之花費。許多產物係針對此等目的為市購可得，但持續需要新穎化合物，其係為更有效、較
15 不昂貴、較低毒性、環境上較安全或具有不同作用位置。

世界專利公報 WO 05/003128 係揭示式 i 之噻唑基六氫吡啶衍生物，作為 MTP (微粒體三酸甘油酯轉移蛋白質) 抑制劑。



其中

20 A 為選自下文基團 a1 與 a2 之基團

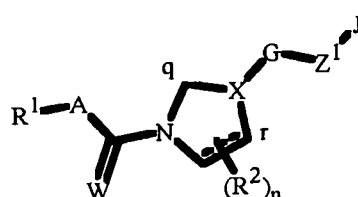


且 R^1 , R^2 , $R^{2'}$, R^3 , R^4 及 R^5 均如揭示內容中之定義。

世界專利公報 WO 04/058751 係揭示關於改變血管張力之六氫吡啶基-噻唑羧醯胺衍生物。

【發明內容】

本發明係關於式 1 化合物，包括其所有幾何與立體異構物、N-氧化物及鹽，含有彼等之農業組合物，及其作為殺真菌劑之用途：



1

其中

R^1 為視情況經取代之苯基、萘基或 5- 或 6-員雜芳族環；

A 為 CHR^{15} 或 NR^{16} ；

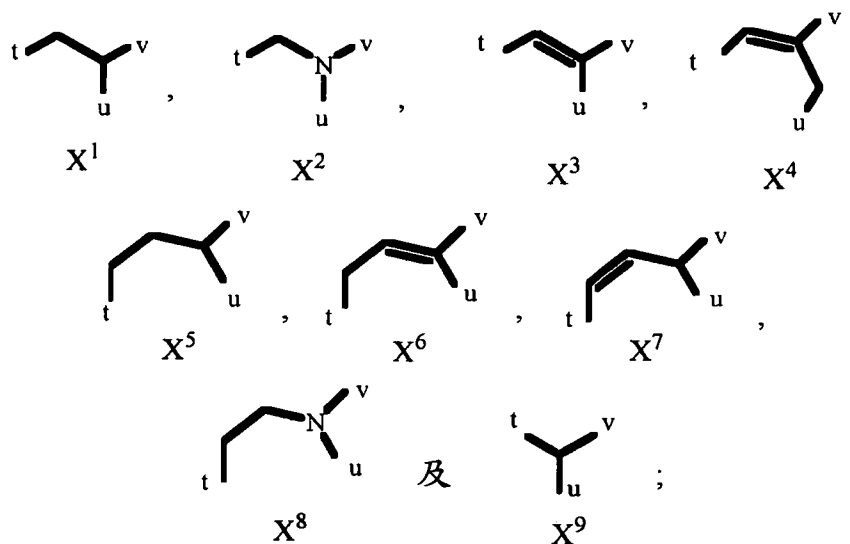
R^{15} 為 H、鹵素、氰基、羥基、-CHO、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 鹵烯基、 C_2 - C_4 鹵炔基、 C_2 - C_4 烷氧烷基、 C_2 - C_4 烷基硫基烷基、 C_2 - C_4 烷基亞磺醯基烷基、 C_2 - C_4 烷基磺醯基烷基、 C_2 - C_4 烷羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_5 烷氧羰基、 C_3 - C_5 烷氧羰基烷基、 C_2 - C_5 烷胺基羰基、 C_3 - C_5 二烷胺基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯基或 C_1 - C_4 鹵烷基磺醯基；

R^{16} 為 H、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷

基、C₂-C₄鹵烯基、C₂-C₄鹵炔基、C₂-C₄烷氧烷基、
C₂-C₄烷基硫基烷基、C₂-C₄烷基亞磺醯基烷基、C₂-C₄
烷基磺醯基烷基、C₂-C₄烷羰基、C₂-C₄鹵烷基羰基、
C₂-C₅烷氧羰基、C₃-C₅烷氧羰基烷基、C₂-C₅烷胺基
羰基、C₃-C₅二烷胺基羰基、C₁-C₄烷基磺醯基或C₁-C₄
鹵烷基磺醯基；

W 為 O 或 S；

X 為選自以下之基團



其中 X¹, X², X³, X⁴, X⁵, X⁶, X⁷, X⁸ 或 X⁹ 之鍵結，其係以 "t" 確認，係連接至以式 1 之 "q" 確認之碳原子，以 "u" 確認之鍵結係連接至以式 1 之 "r" 確認之碳原子，且以 "v" 確認之鍵結係連接至 G；

各 R² 係獨立為 C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 烯基、C₁-C₄ 鹵烷基、C₁-C₄ 烷氧基、鹵素、氰基或羥基；或

兩個 R² 係一起採用為 C₁-C₄ 次烷基或 C₂-C₄ 次烯基，以形成橋接雙環狀或稠合雙環狀環系統；或

連接至藉由雙鍵接合之鄰近環碳原子之兩個 R² 係一起

採用為 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ ，視情況被 1 至 3 個取代基取代，取代基選自 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、鹵素、羥基、胺基、氰基及硝基；

5 G 為視情況經取代之 5-員雜芳族環或 5-員飽和或部份飽和雜環；

J 為 5-、6- 或 7-員環，8- 至 11-員雙環狀環系統或 7- 至 11-員螺環狀環系統，各環或環系統含有環員，選自碳及視情況選用之 1 至 4 個雜原子，選自至高 2 個 O，至高 2 個 S，及至高 4 個 N，且視情況包含 1 至 3 個環員，選自包括 $\text{C}(=\text{O})$ 、 $\text{C}(=\text{S})$ 、 $\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{S}(\text{O})_2$ 及 $\text{SiR}^{17}\text{R}^{18}$ ，各環或環系統視情況被 1 至 5 個獨立選自 R^5 之取代基取代；

各 R^5 係獨立為 H、鹵素、氰基、羥基、胺基、硝基、 $-\text{CHO}$ 、
 15 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ 、 $-\text{NR}^{25}\text{R}^{26}$ 、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_8 環烷基、 C_3 - C_8 鹵環烷基、 C_4 - C_{10} 烷基環烷基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷基、 C_6 - C_{14} 環烷基環烷基、 C_4 - C_{10} 鹵環烷基烷基、 C_5 - C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_3 - C_8
 20 環烯基、 C_3 - C_8 鹵環烯基、 C_2 - C_6 烷氧烷基、 C_4 - C_{10} 環烷氧基烷基、 C_3 - C_8 烷氧基烷氧烷基、 C_2 - C_6 烷基硫基烷基、 C_2 - C_6 烷基亞磺基烷基、 C_2 - C_6 烷基磺基烷基、 C_2 - C_6 烷基亞磺基烷基、 C_2 - C_6 烷基磺基烷基、 C_2 - C_6 烷基胺基烷基、 C_3 - C_8 二烷基胺基烷基、 C_2 - C_6 鹵烷基胺基烷基、 C_4 - C_{10} 環烷基胺基烷基、 C_2 - C_6

- 烷羰基、C₂-C₆鹵烷基羰基、C₄-C₈環烷基羰基、C₂-C₆
 烷氧羰基、C₄-C₈環烷氧基羰基、C₅-C₁₀環烷基烷氧
 羰基、C₂-C₆烷胺基羰基、C₃-C₈二烷胺基羰基、C₄-C₈
 環烷胺基羰基、C₂-C₆鹵烷氧基烷基、C₁-C₆羧烷基、
 5 C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基、C₃-C₈環烷氧基、C₃-C₈
 鹵環烷氧基、C₄-C₁₀環烷基烷氧基、C₂-C₆烯氧基、
 C₂-C₆鹵烯基氧基、C₂-C₆炔氧基、C₂-C₆鹵炔基氧基、
 C₂-C₆烷氧基烷氧基、C₂-C₆烷羰基氧基、C₂-C₆鹵烷
 基羰基氧基、C₄-C₈環烷基羰基氧基、C₃-C₆烷羰基
 10 烷氧基、C₁-C₆烷硫基、C₁-C₆鹵烷硫基、C₃-C₈環烷
 基硫基、C₁-C₆烷基亞磺醯基、C₁-C₆鹵烷基亞磺醯
 基、C₁-C₆烷基磺醯基、C₁-C₆鹵烷基磺醯基、C₃-C₈
 環烷基磺醯基、C₃-C₁₀三烷基矽烷基、C₁-C₆烷基磺
 醯基胺基、C₁-C₆鹵烷基磺醯基胺基或-Z²Q；
 15 R²⁵為H、C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₃-C₈環烷基、C₂-C₆
 烷羰基、C₂-C₆鹵烷基羰基、C₂-C₆烷氧羰基或C₂-C₆
 鹵烷氧基羰基；
 R²⁶為C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₃-C₈環烷基、C₂-C₆烷
 羰基、C₂-C₆鹵烷基羰基、C₂-C₆烷氧羰基、C₂-C₆鹵
 20 烷氧基羰基或-Z⁴Q；
 各R¹⁷與R¹⁸係獨立為C₁-C₅烷基、C₂-C₅烯基、C₂-C₅炔基、
 C₃-C₅環烷基、C₃-C₆鹵環烷基、C₄-C₁₀環烷基烷基、
 C₄-C₇烷基環烷基、C₅-C₇烷基環烷基烷基、C₁-C₅鹵
 烷基、C₁-C₅烷氧基或C₁-C₅鹵烷氧基；

各 Q 係獨立為苯基、苣基、萘基、5-或6-員雜芳族環或
8-至11-員雜芳族雙環狀環系統，各視情況被1至5個
取代基取代，取代基獨立選自在碳原子環員上之 R^7
與在氮原子環員上之 R^{12} ；或

5 各 Q 係獨立為3-至7-員非芳族碳環，5-、6-或7-員非芳族
雜環或8-至11-員非芳族雙環狀環系統，各視情況包
含環員，選自包括 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 及
 $SiR^{17}R^{18}$ ，且視情況被1至5個取代基取代，取代基
獨立選自在碳原子環員上之 R^7 與在氮原子環員上
10 之 R^{12} ；

各 R^7 係獨立為 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6
環烷基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷基、 C_4 - C_{10} 烷基環烷基、
 C_5 - C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯
基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、鹵素、羥基、
15 胺基、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、
 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯
基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4
鹵烷基磺醯基、 C_1 - C_4 烷胺基、 C_2 - C_8 二烷胺基、 C_3 - C_6
環烷胺基、 C_2 - C_4 烷氧烷基、 C_1 - C_4 羥烷基、 C_2 - C_4 烷
20 羰基、 C_2 - C_6 烷氧羰基、 C_2 - C_6 烷羰基氧基、 C_2 - C_6 烷
羰基硫基、 C_2 - C_6 烷胺基羰基、 C_3 - C_8 二烷胺基羰基
或 C_3 - C_6 三烷基矽烷基；或

R^5 與 R^7 係和連結 R^5 與 R^7 之原子一起採用，以形成視情況
經取代之5-至7-員環，含有作為環員之2至7個碳原

子，及視情況選用之1至3個雜原子，選自至高1個O，至高1個S，及至高1個N，且視情況包含1至3個環員，選自包括C(=O)、C(=S)、S(O)、S(O)₂及SiR¹⁷R¹⁸；

5 R¹²為H、C₁-C₃烷基、C₁-C₃烷羰基、C₁-C₃烷氧基或C₁-C₃烷氧羰基；

各Z¹與Z²係獨立為直接鍵結、O、C(=O)、S(O)_m、CHR²⁰或NR²¹；

各Z⁴係獨立為O、C(=O)、S(O)_m或CHR²⁰；

10 各R²⁰係獨立為H、C₁-C₄烷基或C₁-C₄鹵烷基；

各R²¹係獨立為H、C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₃-C₈環烷基、C₂-C₆烷羰基、C₂-C₆鹵烷基羰基、C₂-C₆烷氧羰基或C₂-C₆鹵烷氧基羰基；

各m係獨立為0、1或2；且

15 n為0、1或2；

其條件是：

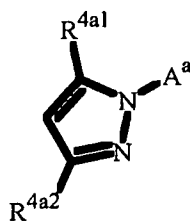
(a) 當R¹為未經取代之噻吩基，X為X¹，且含有X之環為飽和，於式1中，G為未經取代之噻唑環，在其2-位置處連接至X，且在其4-位置處至Z¹，A為CHR¹⁵，
20 R¹⁵為H，且J為異噁唑環，在其4-位置處連接至Z¹，且在其5-位置處被甲基，及在其3-位置處被經間位取代之苯基取代時，則Z¹為O、C(=O)、S(O)_m、CHR²⁰或NR²¹。

更特定言之，本發明係關於式1化合物，包括其所有幾



何與立體異構物、N-氧化物及鹽；其條件是 (b) 當 A 為 NR^{16} ， X 為 X^1 或 X^2 ， Z^1 為直接鍵結，且 J 為苯基時，則 J 係被至少一個不為 H、F、Cl、CN、 OCH_3 、 CF_3 及 CH_3 之 R^5 取代。

本發明亦關於式 1A 化合物



1A

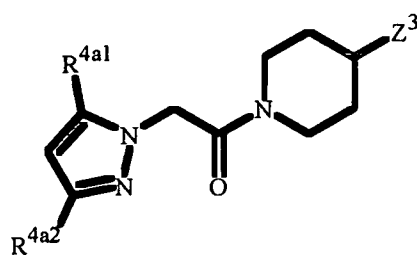
其中

各 R^{4a1} 與 R^{4a2} 係獨立為 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烯基、 C_2 - C_3 炔基、環丙基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_2 - C_3 鹵烯基、 C_2 - C_3 鹵炔基、鹵環丙基、鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 鹵烷氧基、 C_1 - C_2 烷硫基、 C_1 - C_2 鹵烷硫基、 C_2 - C_3 烷氧烷基、 C_2 - C_3 烷羰基、 C_2 - C_3 烷氧羰基、 C_2 - C_3 烷胺基羰基或 C_3 - C_4 二烷胺基羰基；

A^a 為 H、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{H}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{R}^{30}$ 或 $\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{Cl}$ ；且

R^{30} 為 C_1 - C_3 烷基。

本發明亦關於式 1B 化合物



1B

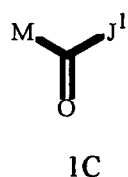
其中

各 R^{4a1} 與 R^{4a2} 係獨立為 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烯基、 C_2 - C_3 炔基、環丙基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_2 - C_3 鹵烯基、 C_2 - C_3 鹵

炔基、鹵環丙基、鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 鹵烷氧基、 C_1 - C_2 烷硫基、 C_1 - C_2 鹵烷硫基、 C_2 - C_3 烷氧烷基、 C_2 - C_3 烷羰基、 C_2 - C_3 烷氧羰基、 C_2 - C_3 烷胺基羰基或 C_3 - C_4 二烷胺基羰基；且

5 Z^3 為 CN 或 $C(=S)NH_2$ 。

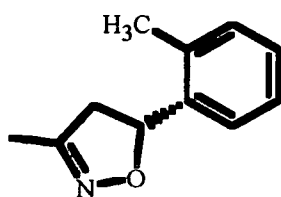
本發明進一步關於式 1C 化合物



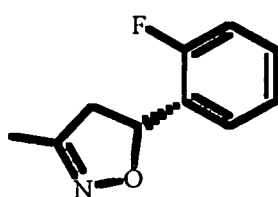
其中

10 M 為 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、羥基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_2 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷胺基、 C_2 - C_8 二烷胺基、1-六氫吡啶基、1-四氫吡咯基或4-嗎福啉基；且

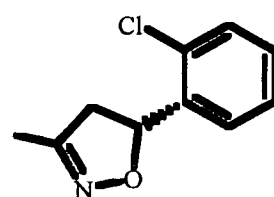
J^1 為



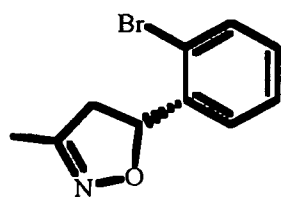
J-29-1



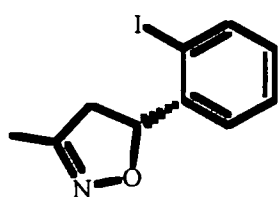
J-29-2



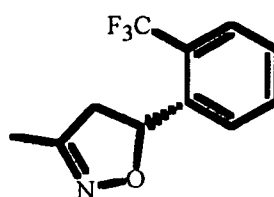
J-29-3



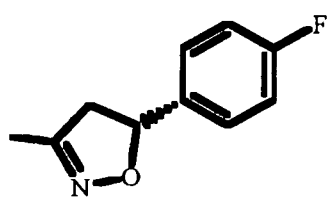
J-29-4



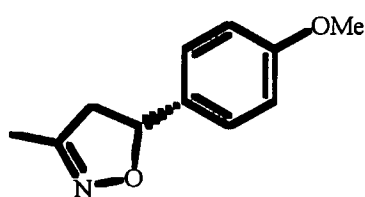
J-29-5



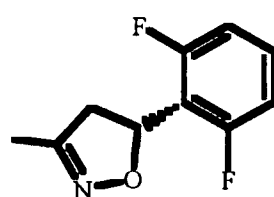
J-29-6



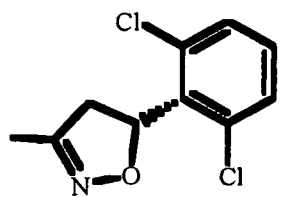
J-29-7



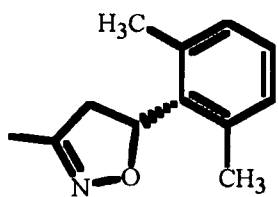
J-29-8



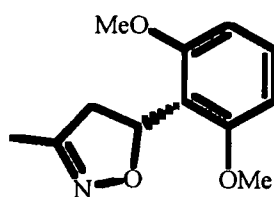
J-29-9



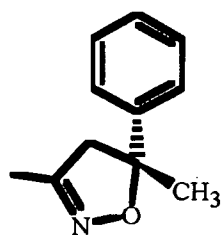
J-29-10



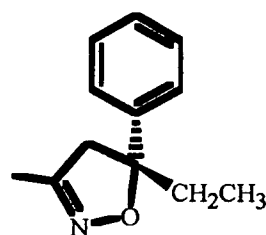
J-29-11



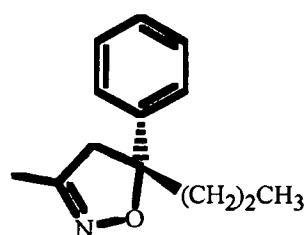
J-29-12



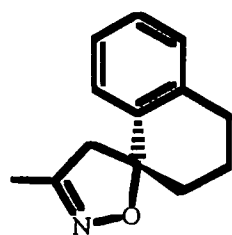
J-29-13



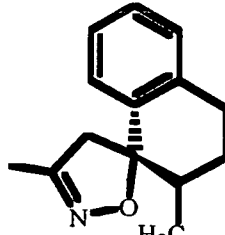
J-29-14



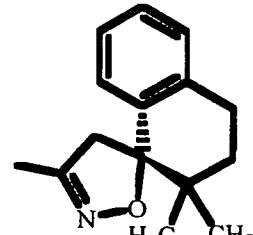
J-29-15



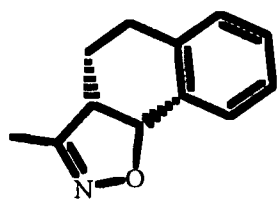
J-29-16



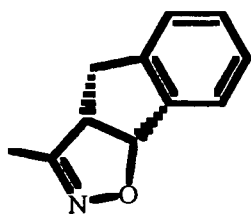
J-29-17



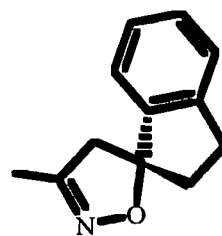
J-29-18



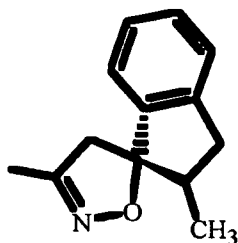
J-29-19



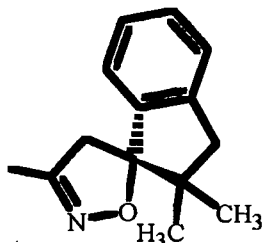
J-29-20



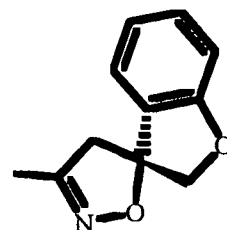
J-29-21



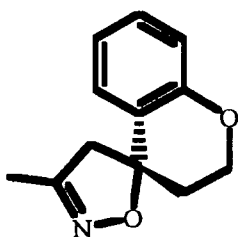
J-29-22



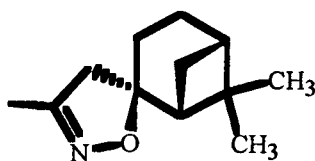
J-29-23



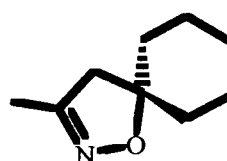
J-29-24



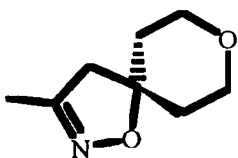
J-29-25



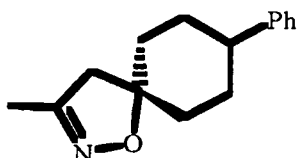
J-29-26



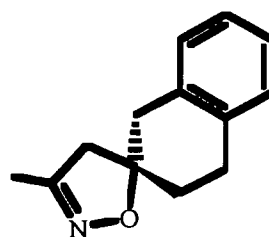
J-29-27



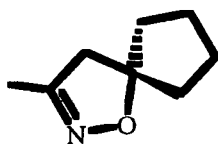
J-29-28



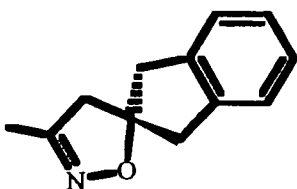
J-29-29



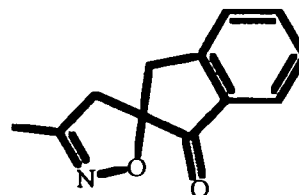
J-29-30



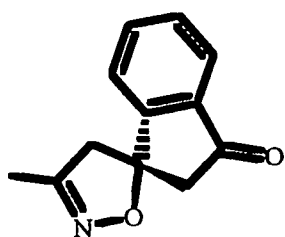
J-29-31



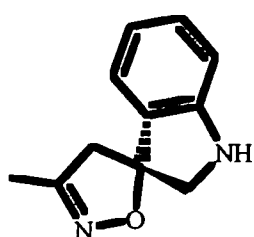
J-29-32



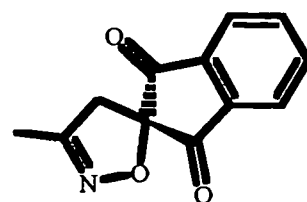
J-29-33



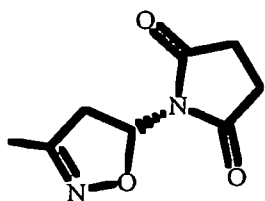
J-29-34



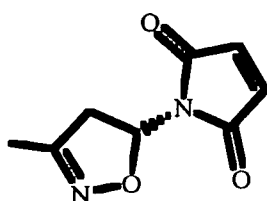
J-29-35



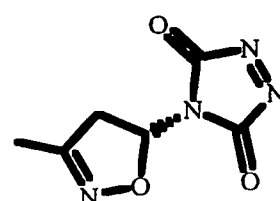
J-29-36



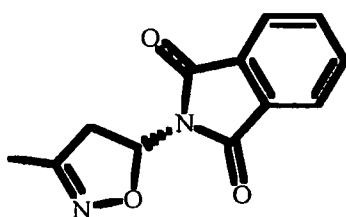
J-29-37



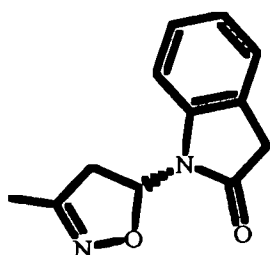
J-29-38



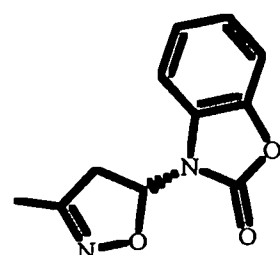
J-29-39



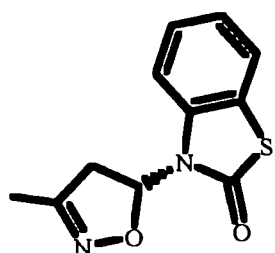
J-29-40



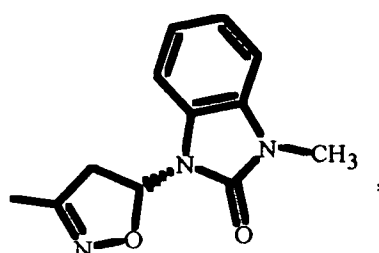
J-29-41



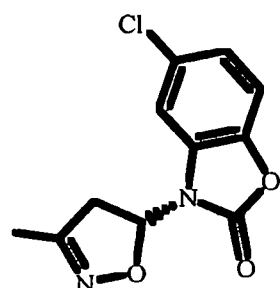
J-29-42



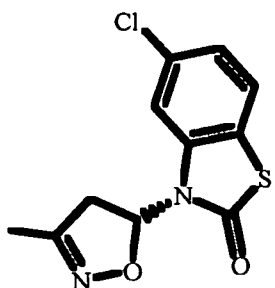
J-29-43



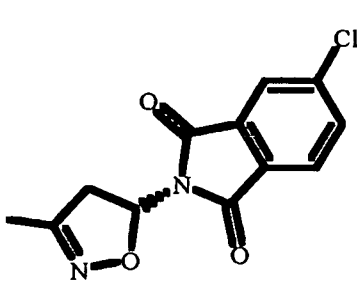
J-29-44



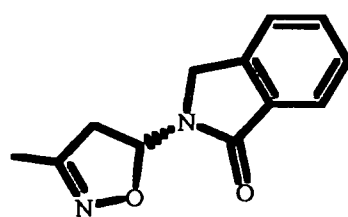
J-29-45



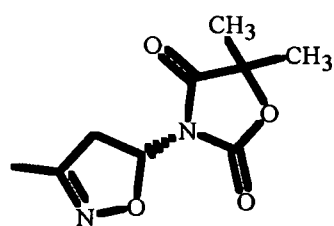
J-29-46



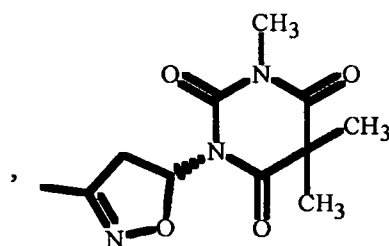
J-29-47



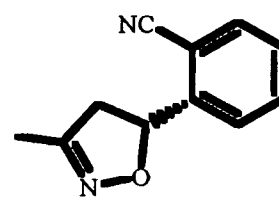
J-29-48



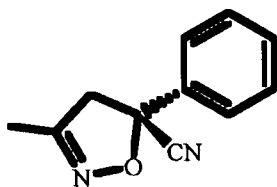
J-29-49



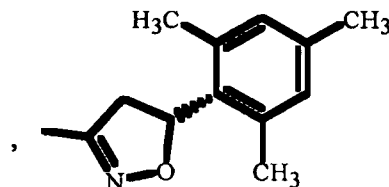
J-29-50



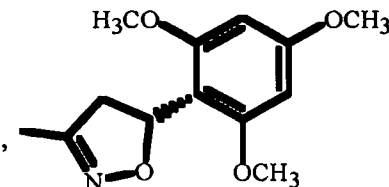
J-29-51



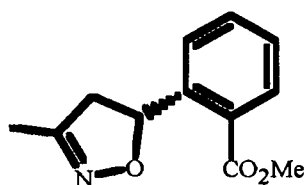
J-29-52



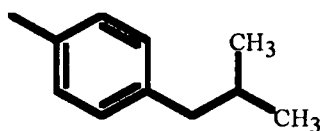
J-29-53



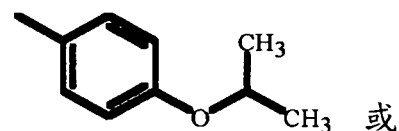
J-29-54



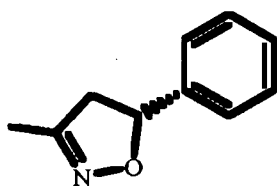
J-29-55



J-29-56



J-29-57



J-29-58

更特定言之，本發明係關於式 1A、1B 及 1C 化合物，包括其所有幾何與立體異構物、N-氧化物或鹽(惟本發明之式 1C 化合物係被限制於在上文發明內容中所描述之立體異構物具體實施例)。

本發明亦關於殺真菌組合物，其包含殺真菌上有效量之式 1 化合物，及至少一種其他成份，選自包括界面活性劑、固體稀釋劑或液體稀釋劑。

本發明亦關於殺真菌組合物，其包含式 1 化合物(包括其所有幾何與立體異構物、N-氧化物及鹽)與至少一種其他殺

真菌劑(例如至少一種具有不同作用位置之其他殺真菌劑)之混合物。

本發明進一步關於一種控制因真菌植物病原所造成之植物疾病之方法，其包括對植物或其部份，或對植物種子施用殺真菌上有效量之式1(包括其所有幾何與立體異構物、N-氧化物及鹽)(例如作成本文中所述之組合物)。

此外，本發明係關於殺真菌組合物，及控制如上文所述植物疾病之方法，惟附帶條件(a)係自式1範圍之定義移除。

本發明之詳細說明

於本文中使用的術語"由...所組成"、"包含"、"包括"、"加入"、"具有"、"具"或其任何其他變型，係意欲涵蓋非排外性包含。例如，包含構件清單之組合物、製程、方法、物件或裝置未必受限於僅此等構件，而是可包含未明確地列示或對此種組合物、製程、方法、物件或裝置固有之其他構件。再者，除非明確相反地敘述，否則"或"係指內含之或，而非排外之或。例如，條件A或B係被下列之任一個滿足：A為真(或存在)而B為偽(或不存在)，A為偽(或不存在)而B為真(或存在)，及A與B均為真(或存在)。

而且，利用"一種"或"一個"係用以描述本發明之構件與成份。此係僅為方便而進行，且賦予本發明之一般意義。此描述應被解讀為包括一個或至少一個，且單數亦包括複數，除非顯而易見其係另有所指。

當在本發明揭示內容與請求項中引述時，"植物"包括植物界之成員，特別是在所有生命階段下之種子植物

(Spermatopsida)，包括幼年期植物(例如正發展成籽苗之發芽中種子)，與成熟生殖階段(例如產生花與種子之植物)。植物之部份係包括典型上生長在生長介質(例如土壤)表面下方之趨地性成員，譬如根部、塊莖、球根及球莖，以及生長在生長介質上方之成員，譬如葉部(包括莖與葉子)、花、果實及種子。

在上文敘述中，"烷基"一詞，無論是單獨或以複合字使用，譬如"烷硫基"或"鹵烷基"，係包括直鏈或分枝狀烷基，譬如甲基、乙基、正-丙基、異-丙基，或不同之丁基、戊基或己基異構物。"烯基"包括直鏈或分枝狀烯類，譬如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基，及不同之丁烯基、戊烯基及己烯基異構物。"烯基"亦包括多烯類，譬如1,2-丙二烯基與2,4-己二烯基。"炔基"包括直鏈或分枝狀炔類，譬如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基，及不同之丁炔基、戊炔基及己炔基異構物。"炔基"亦可包括含有多個參鍵之部份基團，譬如2,5-己二炔基。"次烷基"表示直鏈或分枝狀烷二基。"次烷基"之實例包括 CH_2 、 CH_2CH_2 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ 及不同之次丁基異構物。"次烯基"表示含有一個烯烴鍵之直鏈或分枝狀烯二基。"次烯基"之實例包括 $\text{CH}=\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$ 、 $\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$ 及 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$ 。"烷氧基"包括例如甲氧基、乙氧基、正-丙基氧基、異丙基氧基，及不同之丁氧基、戊氧基及己氧基異構物。"烷氧烷基"表示在烷基上之烷氧基取代。"烷氧烷基"之實例包括 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$

及 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 。"烷硫基"包括分枝狀或直鏈烷硫基部份基團，譬如甲硫基、乙硫基及不同之丙硫基、丁硫基、戊硫基及己硫基異構物。"烷基亞磺醯基"包括烷基亞磺醯基之兩種對掌異構物。"烷基亞磺醯基"之實例包括

5 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})$ ，及不同之丁基亞磺醯基、戊基亞磺醯基及己基亞磺醯基異構物。"烷基磺醯基"之實例包括 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2$ ，及不同之丁基磺醯基、戊基磺醯基及己基磺醯基異構物。"烷羰基"之實例包括

10 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 及 $\text{C}(\text{O})\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 。"烷氧羰基"之實例包括 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$ ，及不同之丁氧基-或戊氧基羰基異構物。"烷胺基羰基"之實例包括 $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(=\text{O})-$ 及不同之丁基胺基-或戊基胺基羰基異構物。"二烷胺基羰基"之實例包括

15 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(=\text{O})-$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})-$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHN}(\text{CH}_3)\text{C}(=\text{O})-$ 及 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})-$ 。"烷胺基"、"二烷胺基"等係類似上文實例作定義。"三烷基矽烷基"包括連接至矽原子及經過矽原子所連結之3個分枝狀及/或直鏈烷基，譬如三甲基矽烷基、三乙基矽烷基及第三-丁基二

20 甲基矽烷基。"環烷基"包括例如環丙基、環丁基、環戊基及環己基。"環烷基烷基"之實例包括環丙基甲基、環戊基乙基，及結合至直鏈或分枝狀烷基之其他環烷基部份基團。"烷基環烷基"表示在環烷基部份基團上之烷基取代。實例

包括4-甲基環己基與3-乙基環戊基。

除非另有指出，否則作為式1成份之"環"或"環系統"(例如取代基J與Q)係為碳環狀或雜環狀。"環系統"一詞表示兩個或多個經連接之環。"螺環狀環系統"一詞表示包含兩個環經連接在單一原子上之環系統(故該環具有共同之單一原子)。作為螺環狀環系統之J部份基團之說明例為在式1C之定義中所描繪之J-29-28。"雙環狀環系統"一詞表示包含共用兩個或多個共同原子之兩個環之環系統。在"稠合雙環狀環系統"中，共同原子係為相鄰，因此該環係共用兩個相鄰原子及連接彼等之鍵結。在"橋接雙環狀環系統"中，共用原子並不相鄰(意即沒有鍵結在橋頭原子之間)。
 "橋接雙環狀環系統"係在概念上經由將一或多個原子之鏈段結合至環之非相鄰環員而形成。

一個環、雙環狀環系統或螺環狀環系統，可為含有超過兩個環之經延長環系統之一部份，其中在該環、雙環狀環系統或螺環狀上之取代基係一起採用而形成其他環，其可在延長之環系統中與其他環呈雙環狀及/或螺環狀關係。例如，在式1C之定義中所描繪之特定J部份基團J-29-26係包含二氫異喹啉環，具有一個 R^5 取代基作為 Z^2Q ，其係為被兩個作為 R^7 之甲基所取代之環丁基環，以及一個 R^7 基團與另一個 R^5 取代基在二氫異喹啉環上一起採用為 $-CH_2CH_2-$ ，以形成其他六員環成份在此環系統中。

"環員"一詞係指形成環或環系統主鏈之原子或其他部份基團(例如 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)$ 或 $S(O)_2$)。"碳環狀環"一詞表

示一種其中形成環主鏈之原子係僅選自碳之環。"碳環狀環系統"一詞表示兩個或多個稠合環，其中形成環主鏈之原子係僅選自碳。"雜環狀環"一詞表示一種其中形成環主鏈之至少一個原子不為碳之環。"雜環系統"一詞表示兩個或多個稠合環，其中形成環主鏈之至少一個原子不為碳。"芳族"表示各環原子基本上係在相同平面上，且具有垂直於環平面之p-軌域，且其中 $(4n + 2)$ 個 π 電子，其中n為正整數，係與該環結合，以順應Huckel氏規則。"雜芳族環"一詞係指芳族之雜環。"飽和雜環"一詞表示僅含有單鍵在環員間之雜環。"部份飽和雜環"一詞表示含有至少一個雙鍵之雜環，但其並非芳族。

在本說明文中所描繪之式1及其他環中之虛線(例如在展示表3中之J-44、J-45、J-48及J-49)係表示所指示之鍵結可為單鍵或雙鍵。除非另有指出，否則雜環與環系統係經過任何可取用之碳或氮連接至式1之其餘部份，其方式是置換該碳或氮上之氫，且在雜環與環系統上之所有取代基係經過任何可取用之碳或氮，藉由置換該碳或氮上之氫而被連接。

"鹵素"一詞，無論是單獨或於複合字中，譬如"鹵烷基"，係包括氟、氯、溴或碘。再者，當以複合字譬如"鹵烷基"使用時，該烷基可被可為相同或不同之鹵原子部份或全部取代。"鹵烷基"之實例包括 F_3C 、 $ClCH_2$ 、 CF_3CH_2 及 CF_3CCl_2 。"鹵烯基"、"鹵炔基"、"鹵環烷基"、"鹵烷氧基"、"鹵烷硫基"等術語係類似"鹵烷基"一詞作定義。"鹵烯基"之實例包括 $(Cl)_2C=CHCH_2$ 與 $CF_3CH_2CH=CHCH_2$ 。"鹵炔基"之實例包

括 $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$ 、 $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$ 及 $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ 。" 鹵烷氧基 " 之實例包括 CF_3O 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ 、 $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 及 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ 。

" 鹵烷硫基 " 之實例包括 CCl_3 、 CF_3S 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$ 及 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$ 。" 鹵烷基亞磺基 " 之實例包括 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})$ 、
5 $\text{CCl}_3(\text{O})$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})$ 及 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})$ 。" 鹵烷基磺基 " 之實例包括 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{CCl}_3(\text{O})_2$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2$ 及 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2$ 。

在取代基中之碳原子總數係藉由 " $\text{C}_i\text{-C}_j$ " 字首表示，其中 i 與 j 為 1 至 10 之數目。例如， $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基磺基係指甲磺基經過丁基磺基； C_2 烷氧烷基係指 CH_3OCH_2 ； C_3 烷氧烷基係
10 指例如 $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 或 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ ；而 C_4 烷氧烷基係指被烷氧基取代之烷基之各種異構物，含有總計四個碳原子，實例包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 與 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 。

當化合物係被帶有下列之取代基取代時，該下標表示該取代基之數目可以改變，則當該取代基之數目大於 1 時，該
15 取代基係獨立選自所定義取代基之組群。再者，當顯示一範圍(例如 $i\text{-}j$ 個取代基)時，則取代基之數目可選自 i 與 j 間之整數(內含)。當基團(例如 J)含有可為氫之取代基(例如 R^5)時，則當此取代基被取為氫時，應明瞭的是，這相當於該基團為未經取代。當可變基團被顯示為視情況連接至一
20 個位置時，例如 $(\text{R}^2)_n$ ，其中 n 可為 0，或作為進一步實例 $(\text{R}^4)_k$ ，其中 k 可為 0，在展示表 1 中，則氫可在該位置上，即使未被敘述於該可變基團(例如 R^2 , R^4)之定義中亦然。當在基團上之一個位置被稱為 " 並未被取代 " 或 " 未經取代 " 時，則氫原子係被連接以佔用任何自由價鍵。連同關於 R^1 ,

R^2 , R^5 , R^7 , G, J 及 Q 所列示基團之 "視情況經取代" 一詞，係指未經取代或具有至少 1 個非氫取代基之基團。除非另有指出，否則此等基團可被如同可藉由在任何可取用之碳或氮原子上以非氫取代基置換氫原子所調節者一樣多之選用取代基取代。通常，選用取代基(當存在時)之數目範圍為 1 至 3。當關於取代基之數目所指定之範圍(例如 x 為整數 0 至 5，在展示表 3 中)超過在環上取代基可取得之位置數目(例如在展示表 3 中，於 J-1 上對於 $(R^5)_x$ 為 2 個位置可取得)時，應明瞭此範圍之實際較高末端係為可取得位置之數目。

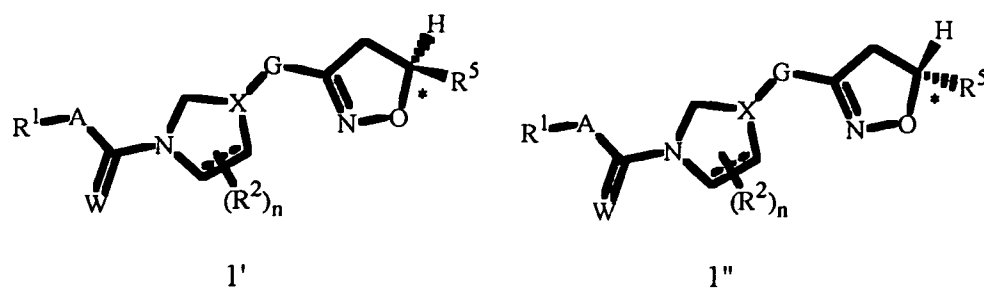
"視情況經取代" 一詞係意謂取代基之數目可為零。例如，片語 "視情況被至高 2 個取代基取代，取代基選自在碳環員上之 R^3 ，及選自在氮環員上之 R^{11} "，係意謂 0、1 或 2 個取代基可存在(若可能連接點之數目允許時)，且因此 R^3 與 R^{11} 取代基之數目可為零。關於基團譬如環或環系統之 "未經取代" 一詞，係意謂該基團未具有任何取代基，惟其對式 1 之其餘部份之一或多個連接除外。"經間位取代之苯基" 一詞係意謂在相對於苯環對式 1 其餘部份之連接之間位上，被非氫取代基取代之苯環。

如上述， R^1 為視情況經取代之苯基、萘基或 5- 或 6-員雜芳族環；G 為視情況經取代之 5-員雜芳族環或 5-員飽和或部份飽和雜環；且 R^5 與 R^7 可和連結 R^5 與 R^7 之原子一起採用，以形成視情況經取代之 5- 至 7-員環，含有作為環員之 2 至 7 個碳原子，及視情況選用之 1 至 3 個雜原子，選自至高 1 個 O，至高 1 個 S，至高 1 個 Si，及至高 1 個 N。關於 R^1 、G、 R^5 及

R^7 定義之 "經取代" 一詞，係指具有至少一個不會使殺真菌活性消失之非氫取代基之基團。由於此等基團為視情況經取代，故其未必具有任何非氫取代基。當此等基團為 "視情況經取代"，而未指示取代基數目時，此等基團可被如可藉由任何可取用之碳或氮原子上以非氫取代基置換氮原子所調節者一樣多之選用取代基取代。

在本發明揭示內容中取代基之命名，係利用經認定提供簡明之術語，以對熟諳此藝者正確地傳達化學結構。為簡明起見，位標描述符號可被省略；"吡啶 -1-基" 係意謂 "1H-吡啶 -1-基"，根據化學文摘命名法系統。"吡啶基 (pyridyl)" 一詞係與 "吡啶基 (pyridinyl)" 同義。所列出取代基之順序可不同於化學文摘系統，若此差異不會影響其意義時。

本發明化合物可以一或多種立體異構物存在。各種立體異構物包括對掌異構物、非對映異構物、非向性異構物及幾何異構物。熟諳此藝者將明瞭的是，一種立體異構物當相對於其他立體異構物為富含時或當與其他立體異構物分離時，可較具活性及/或可顯示有利作用。此外，熟練技師明瞭如何分離、濃縮及/或選擇性地製備該立體異構物。本發明化合物可以立體異構物之混合物、個別立體異構物或以光學活性形式存在。例如，當 J 為在 3-位置處結合至式 1 之其餘部份之 J-29，且 J-29 在 5-位置處具有 H 以外之一個 R^5 取代基時，則式 1 具有一個對掌中心在 R^5 所結合之碳原子上。兩種對掌異構物係被描繪為式 1' 與式 1"，具有以星號 (*) 確認之對掌中心。



本發明包括外消旋混合物，例如式 1' 與 1'' 之等量對掌異構物。此外，相較於外消旋混合物，本發明係包括富含式 1 之一種對掌異構物之化合物。亦被包含者為式 1 化合物之基本上純對掌異構物，例如式 1' 與式 1''。

當對掌異構上富含時，一種對掌異構物係比另一種以較大量存在，且富含之程度可藉由對掌異構物過量("ee")之表示法定義，其係被定義為 $(2x-1) \cdot 100\%$ ，其中 x 為主要對掌異構物在混合物中之莫耳分率(例如 20% 之 ee 係相應於對掌異構物之 60:40 比例)。

本發明之組合物較佳係具有至少 50% 對掌異構物過量；更佳為至少 75% 對掌異構物過量；又更佳為至少 90% 對掌異構物過量；而最佳為至少 94% 對掌異構物過量之較具活性異構物。特別值得注意的是較具活性異構物之對掌異構上純具體實施例。

式 1 化合物可包含其他對掌中心。例如，取代基及其他分子成份，譬如 R^4 , R^5 , R^7 , G, J, Q 及 X^1 至 X^9 ，本身可含有對掌中心。本發明包括外消旋混合物，以及富含且基本上純立體組態在此等其他對掌中心處。

本發明化合物可以一或多種構形異構物存在，此係由於在式 1 中環繞醯胺鍵結(例如 C(W)-N)之限制旋轉所致。本發

明包括構形異構物之混合物。此外，本發明包括相對於其他異構物，富含一種構形異構物之化合物。

於展示表1、2、3及4中所描繪之一些不飽和環與環系統可具有單與雙鍵之排列在環員之間，不同於所描繪者。關於環原子特定排列之此種不同鍵結排列，係相應於不同互變異構物。對於此等不飽和環與環系統，所描繪之特定互變異構物係被視為關於所顯示環原子排列可能之所有互變異構物之代表例。列出併入展示表中所描繪之環與環系統之特定化合物之表，可涉及一種互變異構物，其係不同於展示表中所描繪之互變異構物。

本發明化合物包括N-氧化物衍生物。熟諳此藝者將明瞭的是，並非所有含氮雜環均可形成N-氧化物，因為氮需要可取用之未共用電子對，供氧化成氧化物；熟諳此藝者將明瞭可形成N-氧化物之含氮雜環。熟諳此藝者亦將明瞭三級胺類可形成N-氧化物。關於製備雜環與三級胺類之N-氧化物之合成方法，係為熟諳此藝者極為習知，包括雜環與三級胺類以過氧酸類，譬如過醋酸與間-氯過苯甲酸(MCPBA)，過氧化氫，烷基氫過氧化物，譬如第三-丁基過氧化氫，過硼酸鈉，及二環氧乙烷，譬如二甲基二環氧乙烷之氧化作用。關於製備N-氧化物之此等方法已被廣泛地描述並回顧於文獻中，參閱例如：T. L. Gilchrist, 綜合有機合成，第7卷，第748-750頁，S. V. Ley編著，Pergamon出版社；M. Tisler與B. Stanovnik, 綜合雜環化學，第3卷，第18-20頁，A. J. Boulton與A. McKillop編著，Pergamon出版社；M. R. Grimmett與

B. R. T. Keene, 雜環化學上之進展, 第43卷, 第149-161頁, A. R. Katritzky 編著, 大學出版社; M. Tisler 與 B. Stanovnik, 雜環化學上之進展, 第9卷, 第285-291頁, A. R. Katritzky 與 A. J. Boulton 編著, 大學出版社; 及 G. W. H. Cheeseman 與 E. S. G. Werstiuk, 雜環化學上之進展, 第22卷, 第390-392頁, A. R. Katritzky 與 A. J. Boulton 編著, 大學出版社。

本發明之式1化合物可呈農業上適當鹽之形式。熟諳此藝者明瞭由於在此環境中及在生理學條件下, 化學化合物之鹽係與其相應之非鹽形式呈平衡, 故鹽係共有非鹽形式之生物利用性。因此, 式1化合物之極多種鹽可用於控制因真菌植物病原所造成之植物疾病(意即係為農業上適當)。式1化合物之鹽包括與無機或有機酸類之酸加成鹽, 該酸例如氫溴酸、鹽酸、硝酸、磷酸、硫酸、醋酸、丁酸、反丁烯二酸、乳酸、順丁烯二酸、丙二酸、草酸、丙酸、柳酸、酒石酸、4-甲苯磺酸或戊酸。當式1化合物含有酸性部份基團譬如羧酸或酚時, 鹽亦包括以有機或無機鹼所形成者, 該鹼譬如吡啶、三乙胺或氨, 或鈉、鉀、鋰、鈣、鎂或鋇之胺化物、氫化物、氫氧化物或碳酸鹽。因此, 本發明包括選自式1、1A、1B及1C之化合物, 其N-氧化物及鹽。

本發明之具體實施例包括：

具體實施例 1. 式 1 化合物，其中 A 為 CHR^{15} 。

具體實施例 1a. 具體實施例 1 之化合物，其中 R^{15} 為 H、鹵素、氰基、羥基、 $-\text{CHO}$ 、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基或 C_2 - C_5 烷氧羰基。

具體實施例 1b. 具體實施例 1a 之化合物，其中 R^{15} 為 H、氰基、羥基、甲基或甲氧羰基。

具體實施例 1c. 具體實施例 1b 之化合物，其中 R^{15} 為 H。

具體實施例 2. 式 1 化合物，其中 A 為 NR^{16} 。

10 具體實施例 2a. 具體實施例 2 之化合物，其中 R^{16} 為 H、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基或 C_2 - C_4 烷氧羰基。

具體實施例 2b. 具體實施例 2a 之化合物，其中 R^{16} 為 H、甲基、甲基羰基或甲氧羰基。

15 具體實施例 2c. 具體實施例 2b 之化合物，其中 R^{16} 為 H。

具體實施例 3. 式 1 化合物，其中 W 為 O。

具體實施例 4. 式 1 化合物，其中 W 為 S。

具體實施例 5. 式 1 化合物，其中各 R^2 係獨立為 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基、鹵素、氰基或羥基。

20 具體實施例 5a. 具體實施例 5 之化合物，其中各 R^2 係獨立為甲基、甲氧基、氰基或羥基。

具體實施例 5b. 具體實施例 5a 之化合物，其中各 R^2 為甲基。

具體實施例 6. 式 1 化合物，其中 n 為 0 或 1。

具體實施例 7. 具體實施例 6 之化合物，其中 n 為 0。

具體實施例 8. 式 1 化合物，其中 X 為 X^1 、 X^2 或 X^3 。

具體實施例 9. 具體實施例 8 之化合物，其中 X 為 X^1 或 X^2 。

具體實施例 10. 具體實施例 9 之化合物，其中 X 為 X^1 。

5 具體實施例 11. 式 1 化合物，其中包含 X 之環為飽和 (意即僅含有單鍵)。

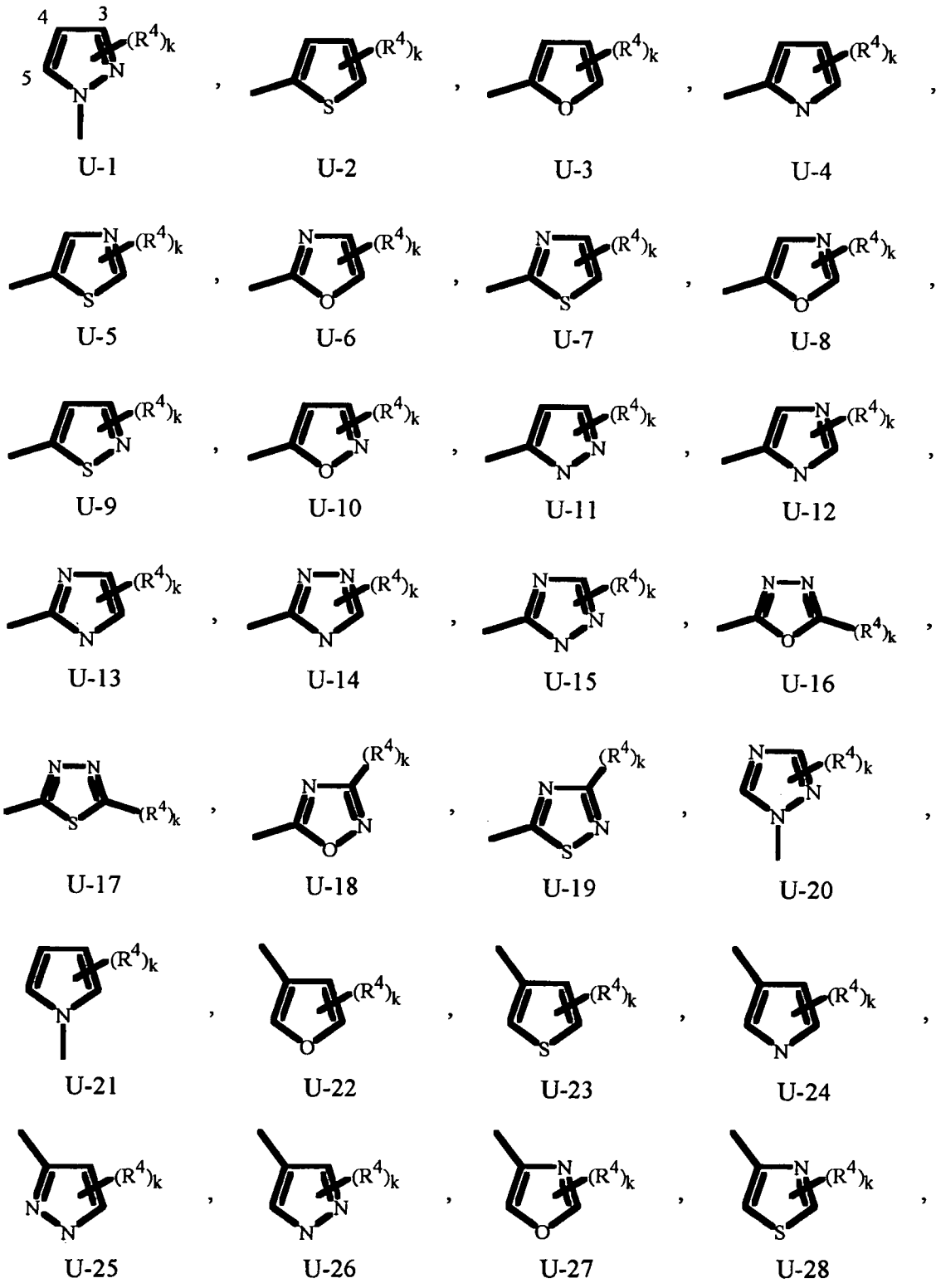
具體實施例 12. 式 1 化合物，其中 R^1 為苯基或 5- 或 6- 員雜芳族環，視情況被 1-2 個取代基取代，取代基獨立選自在碳環員上之 R^{4a} 與在氮環員上之 R^{4b} ；

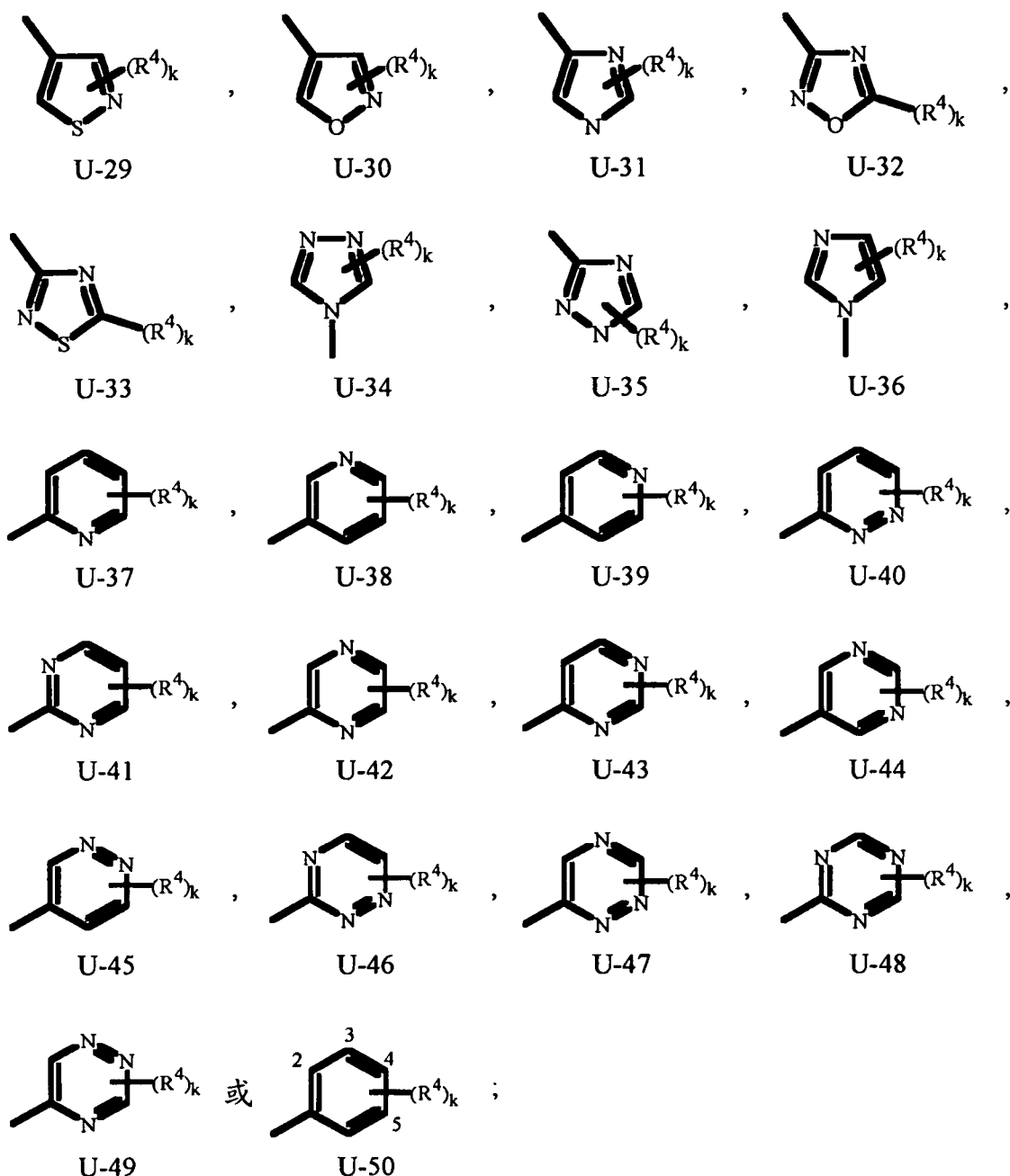
10 各 R^{4a} 係獨立為 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷基、 C_4 - C_{10} 烷基環烷基、 C_5 - C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、鹵素、羥基、胺基、
15 氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷基磺醯基、 C_1 - C_4 烷胺基、 C_2 - C_8 二烷胺基、 C_3 - C_6 環
20 烷胺基、 C_2 - C_4 烷氧烷基、 C_1 - C_4 羥烷基、 C_2 - C_4 烷羰基、 C_2 - C_6 烷氧羰基、 C_2 - C_6 烷羰基氧基、 C_2 - C_6 烷羰基硫基、 C_2 - C_6 烷胺基羰基、 C_3 - C_8 二烷胺基羰基或
 C_3 - C_6 三烷基矽烷基；且

各 R^{4b} 係獨立為 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_6 烯基、 C_3 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_3 - C_6 鹵烯基、 C_3 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基或 C_2 - C_4 烷氧烷基。

具體實施例 13. 具體實施例 12 之化合物，其中 R^1 為在展示表 1 中所描繪 U-1 至 U-50 之一；

展示表 1





其中

當 R^4 連接至碳環員時，該 R^4 係選自 R^{4a} ，而當 R^4 連接至

氮環員(例如在 U-4、U-11 至 U-15、U-24 至 U-26、U-31

或 U-35 中)時，該 R^4 係選自 R^{4b} ；且

k 為 0、1 或 2。

具體實施例 14. 具體實施例 13 之化合物，其中 R^1 係選自

U-1 至 U-5、U-8、U-11、U-13、U-15、U-20 至 U-28、U-31、

U-36 至 U-39 及 U-50。

具體實施例 15. 具體實施例 14 之化合物，其中 R^1 係選自 U-1 至 U-3、U-5、U-8、U-11、U-13、U-20、U-22、U-23、U-25 至 U-28、U-36 至 U-39 及 U-50。

5 具體實施例 16. 具體實施例 15 之化合物，其中 R^1 係選自 U-1 至 U-3、U-11、U-13、U-20、U-22、U-23、U-36 至 U-39 及 U-50。

具體實施例 17. 具體實施例 16 之化合物，其中 R^1 為 U-1 或 U-50。

10 具體實施例 18. 具體實施例 17 之化合物，其中 R^1 為 U-1。

具體實施例 19. 具體實施例 17 之化合物，其中 R^1 為 U-50。

具體實施例 20. 具體實施例 12 與 13 之任一項之化合物，其中各 R^{4a} 係獨立為 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烯基、 C_2 - C_3 炔基、環丙基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_2 - C_3 鹵烯基、 C_2 - C_3 鹵炔基、鹵環丙基、鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 鹵烷氧基、 C_1 - C_2 烷硫基、 C_1 - C_2 鹵烷硫基、 C_2 - C_3 烷氧烷基、 C_2 - C_3 烷羰基、 C_2 - C_3 烷氧羰基、 C_2 - C_3 烷基胺基羰基或 C_3 - C_4 二烷基胺基羰基。

20 具體實施例 21. 具體實施例 20 之化合物，其中各 R^{4a} 係獨立為 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烯基、 C_2 - C_3 炔基、環丙基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_2 - C_3 鹵烯基、 C_2 - C_3 鹵炔基、鹵環丙基、鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基。

具體實施例 22. 具體實施例 21 之化合物，其中各 R^{4a} 係獨立為鹵素、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2

鹵烷氧基。

具體實施例 23. 具體實施例 21 之化合物，其中各 R^{4a} 係獨立為鹵素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基或 C_1 - C_2 烷氧基。

具體實施例 24. 具體實施例 23 之化合物，其中各 R^{4a} 係獨立為 C_1 - C_2 烷基、三氟甲基、Cl、Br、I 或甲氧基。

具體實施例 25. 具體實施例 24 之化合物，其中各 R^{4a} 係獨立為 C_1 - C_2 烷基、三氟甲基、Cl 或 Br。

具體實施例 26. 具體實施例 12 與 13 之任一項之化合物，其中各 R^{4b} 係獨立為 C_1 - C_3 烷基、 C_3 烯基(例如烯丙基)、 C_3 炔基(例如炔丙基)、環丙基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C^3 鹵烯基、 C_3 鹵炔基、鹵環丙基或 C_2 - C_3 烷氧烷基。

具體實施例 27. 具體實施例 26 之化合物，其中各 R^{4b} 係獨立為 C_1 - C_3 烷基、 C_3 烯基、 C_3 炔基、環丙基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_3 鹵烯基或鹵環丙基。

具體實施例 28. 具體實施例 27 之化合物，其中各 R^{4b} 係獨立為 C_1 - C_2 烷基或 C_1 - C_2 鹵烷基。

具體實施例 29. 具體實施例 28 之化合物，其中各 R^{4b} 係獨立為 C_1 - C_2 烷基或三氟甲基。

具體實施例 30. 具體實施例 29 之化合物，其中各 R^{4b} 係獨立為 C_1 - C_2 烷基。

具體實施例 31. 具體實施例 13 之化合物，其中 k 為 1 或 2，且至少一個 R^4 為 Cl。

具體實施例 32. 具體實施例 13 之化合物，其中 k 為 1 或 2，且至少一個 R^4 為 Br。

具體實施例 33. 具體實施例 13 之化合物，其中 k 為 1 或 2，
且至少一個 R^4 為甲基。

具體實施例 34. 具體實施例 13 之化合物，其中 k 為 1 或 2，
且至少一個 R^4 為乙基。

5 具體實施例 35. 具體實施例 13 之化合物，其中 k 為 1 或 2，
且至少一個 R^4 為三氟甲基。

具體實施例 36. 具體實施例 13 之化合物，其中 k 為 1 或 2，
且至少一個 R^4 為甲氧基。

具體實施例 37. 具體實施例 18 之化合物，其中 k 為 1，且 R^4
10 係連接至 U-1 之 3- 或 5-位置。

具體實施例 38. 具體實施例 18 之化合物，其中 k 為 2，且一
個 R^4 係連接至 U-1 之 3-位置，而另一個 R^4 係連接至 5-位
置。

具體實施例 39. 具體實施例 19 之化合物，其中 k 為 1，且 R^4
15 係連接至 U-50 之 2- 或 3-位置。

具體實施例 40. 具體實施例 19 之化合物，其中 k 為 2，且一
個 R^4 係連接至 U-50 之 2-位置，而另一個 R^4 係連接至 5-位
置。

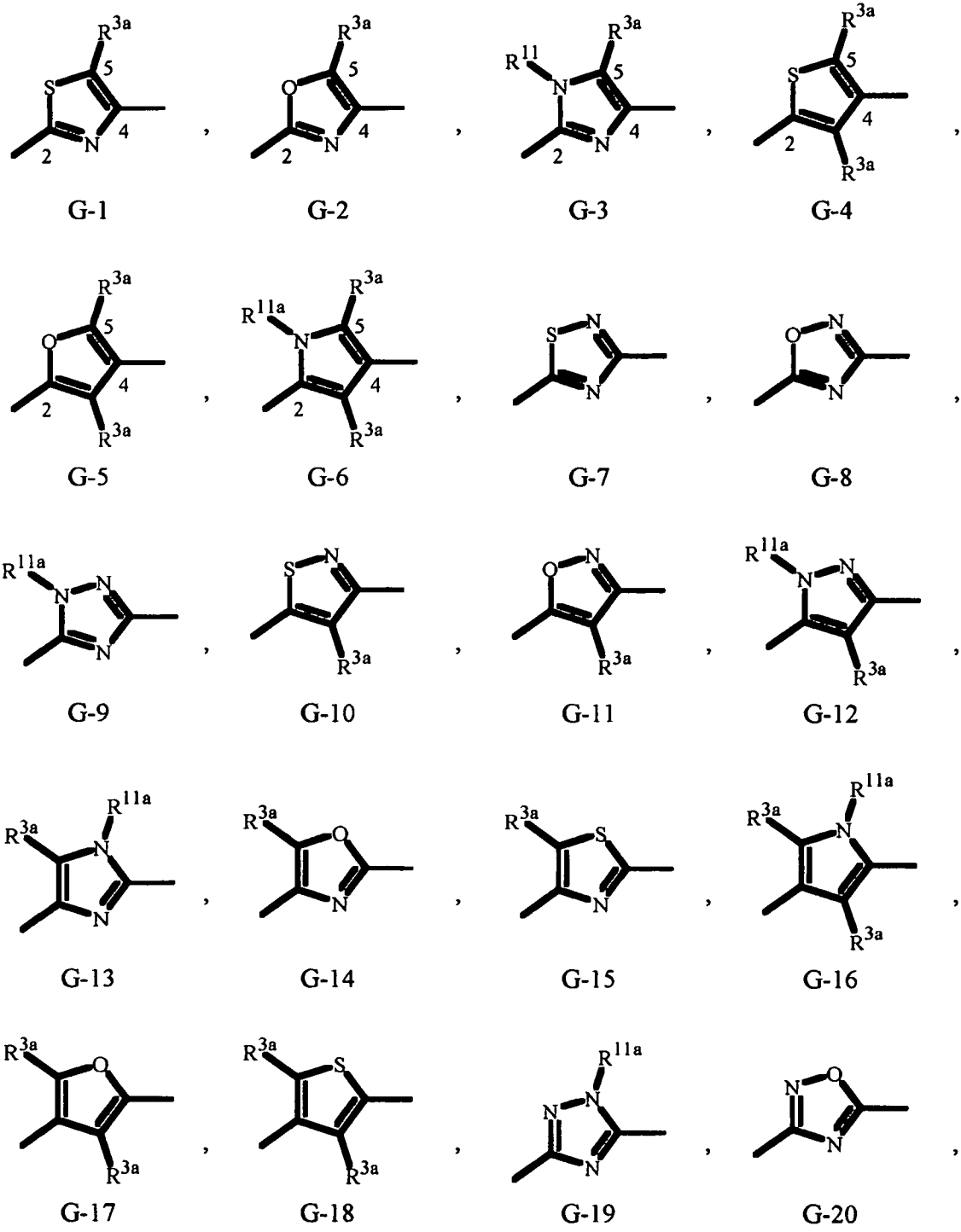
具體實施例 41. 式 1 化合物，其中 G 為 5-員雜芳族環或 5-員
20 飽和或部份飽和雜環，各環係視情況被至高 2 個取代基
取代，取代基選自在碳環員上之 R^3 ，及選自在氮環員上
之 R^{11} ；

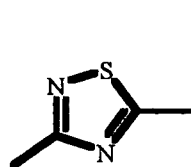
各 R^3 係獨立為 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基或鹵素；且

各 R^{11} 係獨立為 C_1 - C_3 烷基。

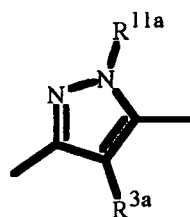
具體實施例 42. 具體實施例 41 之化合物，其中 G 為在展示表 2 中所描繪 G-1 至 G-59 之一；

展示表 2

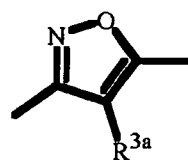




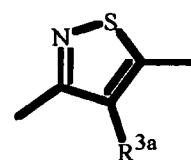
G-21



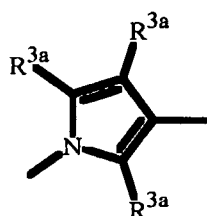
G-22



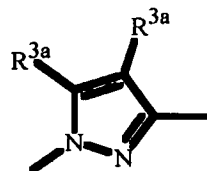
G-23



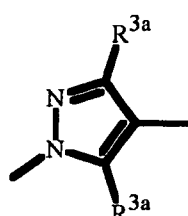
G-24



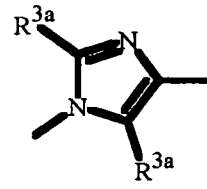
G-25



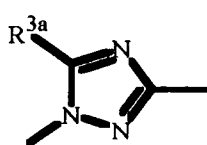
G-26



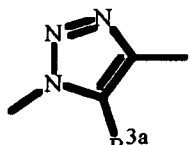
G-27



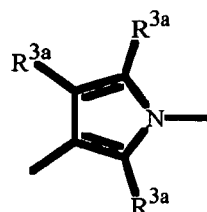
G-28



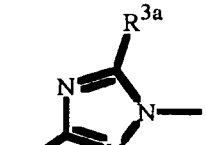
G-29



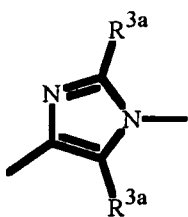
G-30



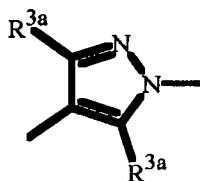
G-31



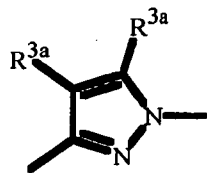
G-32



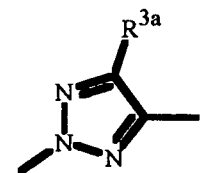
G-33



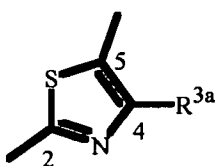
G-34



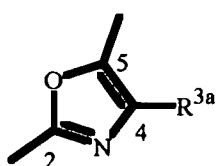
G-35



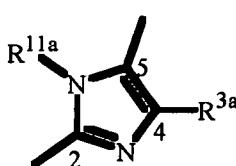
G-36



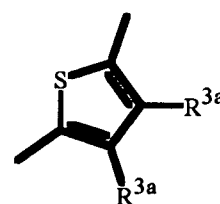
G-37



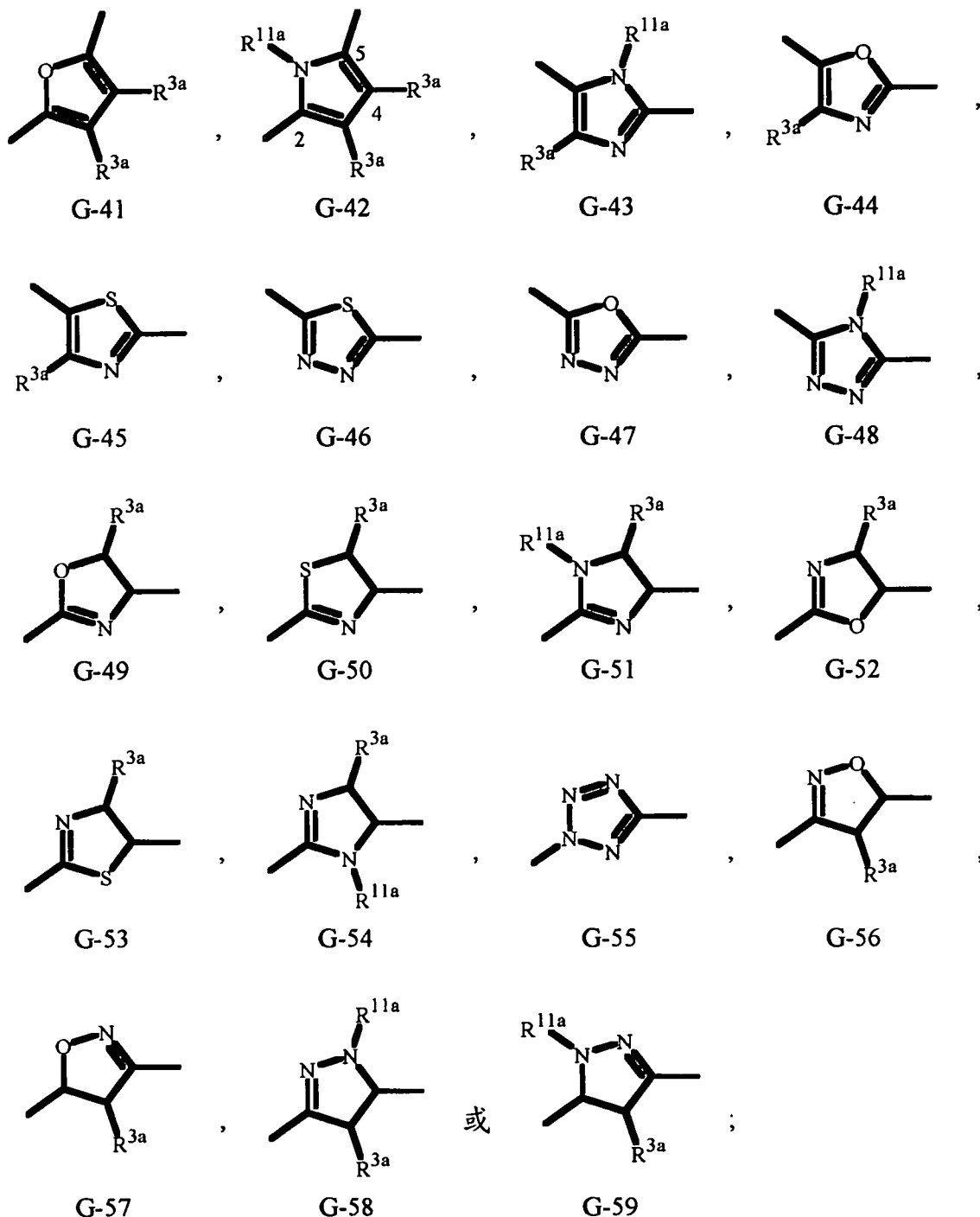
G-38



G-39



G-40



其中凸出至左邊之鍵結係結合至X，而凸出至右邊之鍵結係結合至Z¹；各R^{3a}係獨立選自H或R³；且R^{11a}係選自H或R¹¹；

5 其條件是：

當G為G-6、G-16或G-42，且各R^{3a}不為H時，則R^{11a}為H；

當G為G-25或G-31時，則至少一個R^{3a}為H；及

當 G 為 G-31 至 G-35 之一時，則 Z^1 為直接鍵結或 CHR^{20} 。

具體實施例 43. 具體實施例 42 之化合物，其中 G 係選自 G-1 至 G-3、G-7、G-8、G-10、G-11、G-14、G-15、G-23、G-24、G-26 至 G-28、G-30、G-36 至 G-38 及 G-49 至 G-55。

5 具體實施例 44. 具體實施例 43 之化合物，其中 G 係選自 G-1、G-2、G-7、G-8、G-14、G-15、G-23、G-24、G-26、G-27、G-36、G-37、G-38、G-49、G-50 及 G-55。

具體實施例 45. 具體實施例 44 之化合物，其中 G 係選自 G-1、G-2、G-15、G-26、G-27、G-36、G-37 及 G-38。

10 具體實施例 46. 具體實施例 45 之化合物，其中 G 係選自 G-1、G-2、G-15、G-26 及 G-36。

具體實施例 47. 具體實施例 46 之化合物，其中 G 為 G-1。值得注意的是此等化合物在具體實施例 1 至 40、具體實施例 52 至 83 及具體實施例 A1 至 A5 內之具體實施例。

15 具體實施例 48. 具體實施例 46 之化合物，其中 G 為 G-2。值得注意的是此等化合物在具體實施例 1 至 40、具體實施例 52 至 83 及具體實施例 A1 至 A5 內之具體實施例。

具體實施例 49. 具體實施例 46 之化合物，其中 G 為 G-15。值得注意的是此等化合物在具體實施例 1 至 40、具體實施例 52 至 83 及具體實施例 A1 至 A5 內之具體實施例。

20 具體實施例 50. 具體實施例 46 之化合物，其中 G 為 G-26。值得注意的是此等化合物在具體實施例 1 至 40、具體實施例 52 至 83 及具體實施例 A1 至 A5 內之具體實施例。

具體實施例 51. 具體實施例 46 之化合物，其中 G 為 G-36。

值得注意的是此等化合物在具體實施例1至40、具體實施例52至83及具體實施例A1至A5內之具體實施例。

具體實施例52. 具體實施例41至51之任一項之化合物，其中 R^{3a} 為H、 C_1 - C_3 烷基或鹵素。

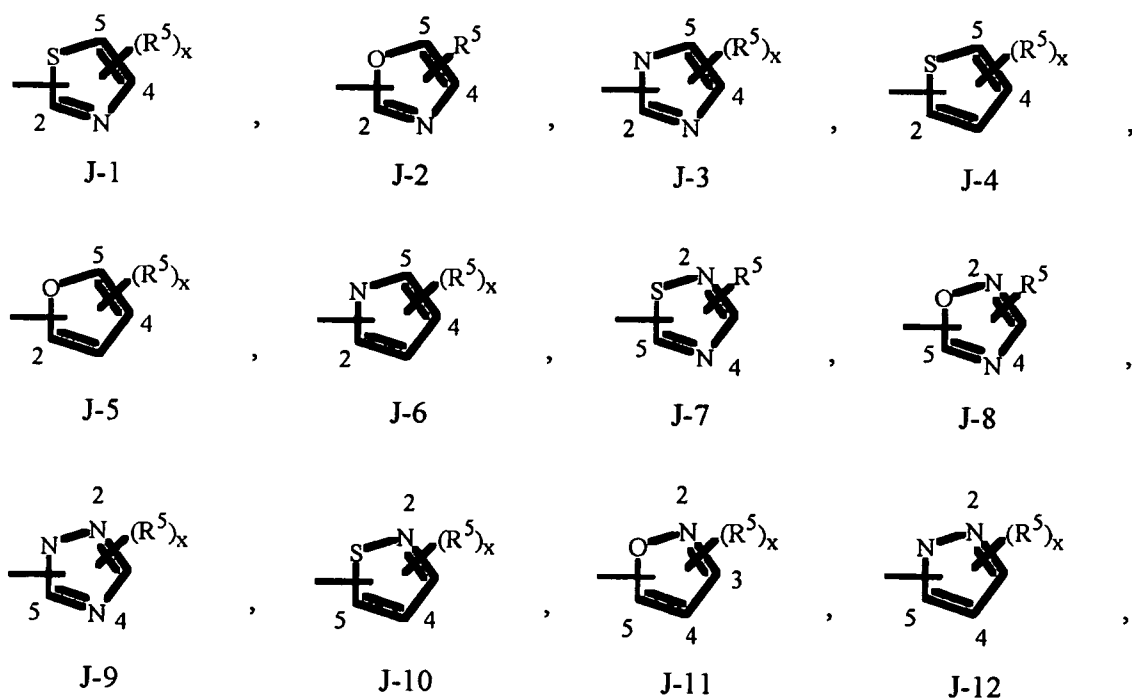
5 具體實施例53. 具體實施例52之化合物，其中 R^{3a} 為H或甲基。

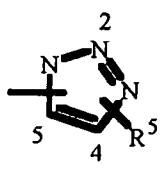
具體實施例54. 具體實施例41至51之任一項之化合物，其中 R^{3a} 為H，且 R^{11a} 為H或甲基。

10 具體實施例55. 式1與具體實施例41至51之任一項之化合物，其中G為未經取代。

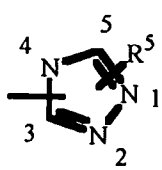
具體實施例56. 式1化合物，其中J為在展示表3中所描繪J-1至J-82之一；

展示表3

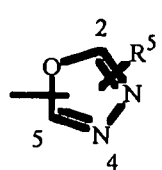




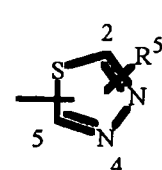
J-13



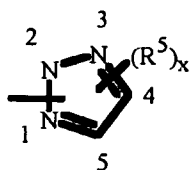
J-14



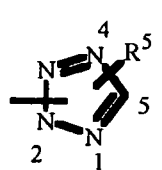
J-15



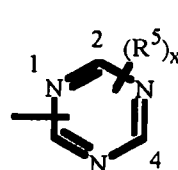
J-16



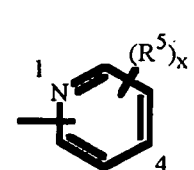
J-17



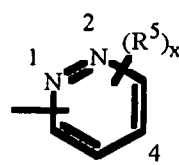
J-18



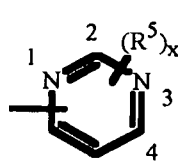
J-19



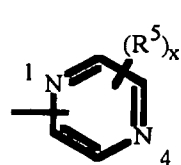
J-20



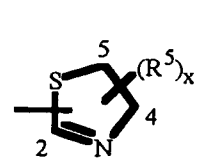
J-21



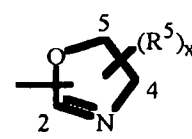
J-22



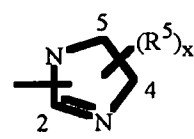
J-23



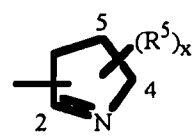
J-24



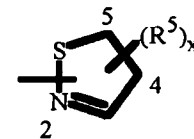
J-25



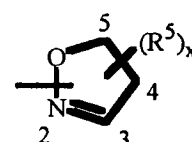
J-26



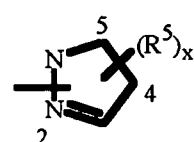
J-27



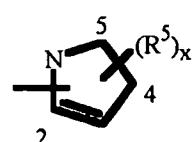
J-28



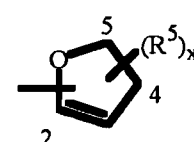
J-29



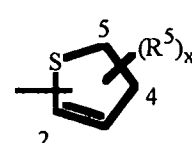
J-30



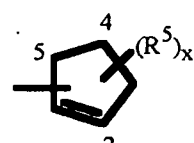
J-31



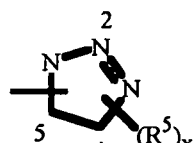
J-32



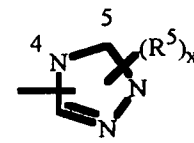
J-33



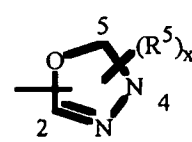
J-34



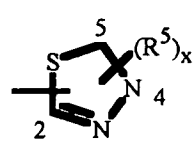
J-35



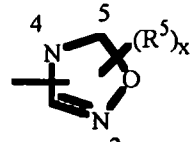
J-36



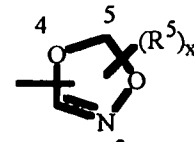
J-37



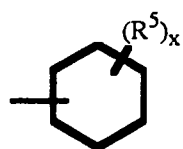
J-38



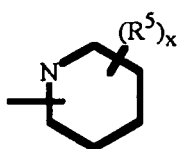
J-39



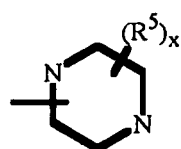
J-40



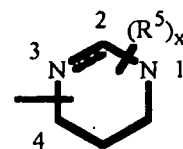
J-41



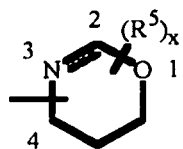
J-42



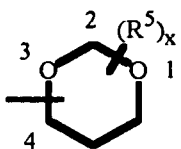
J-43



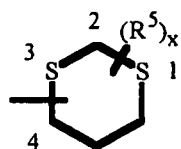
J-44



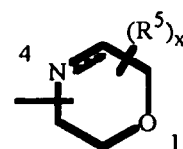
J-45



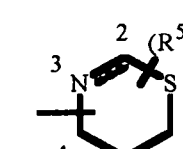
J-46



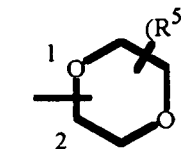
J-47



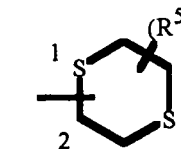
J-48



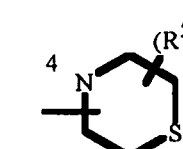
J-49



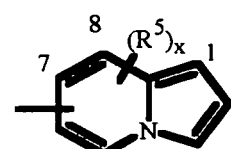
J-50



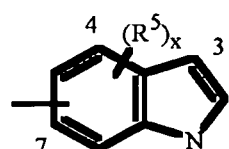
J-51



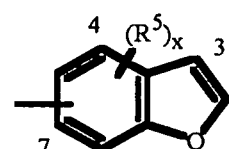
J-52



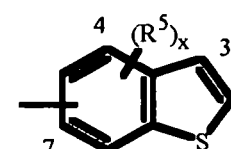
J-53



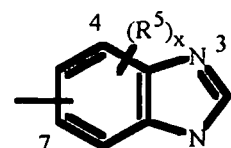
J-54



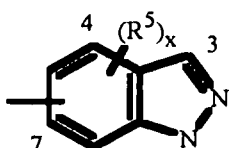
J-55



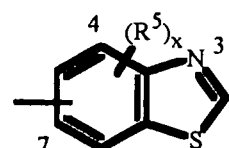
J-56



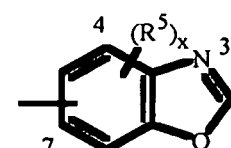
J-57



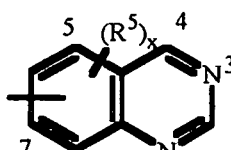
J-58



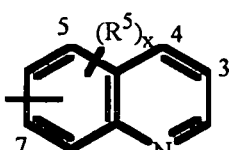
J-59



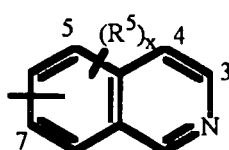
J-60



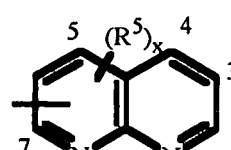
J-61



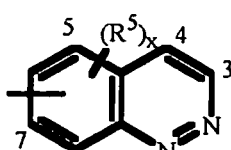
J-62



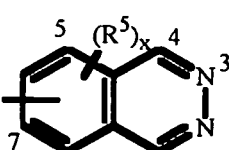
J-63



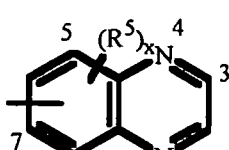
J-64



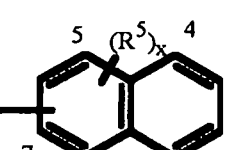
J-65



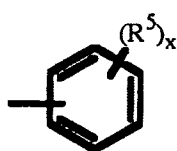
J-66



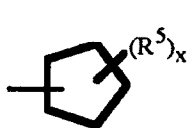
J-67



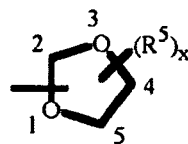
J-68



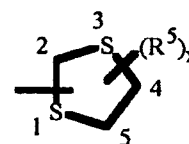
J-69



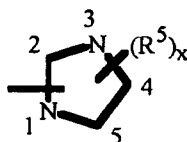
J-70



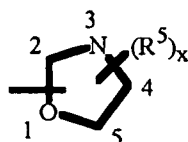
J-71



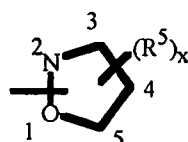
J-72



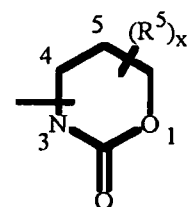
J-73



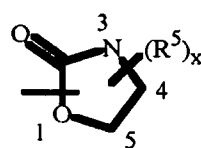
J-74



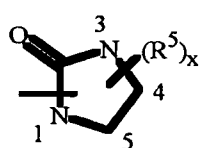
J-75



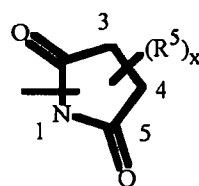
J-76



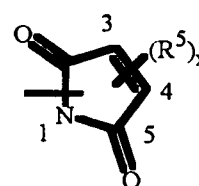
J-77



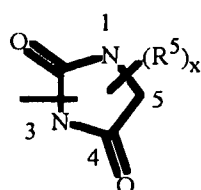
J-78



J-79

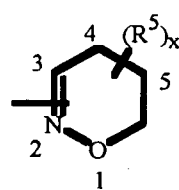


J-80



J-81

或



J-82

其中所顯示凸出至左邊之鍵結係結合至 Z^1 ；且 x 為 0 至 5 之整數。

5 具體實施例 57. 具體實施例 56 之化合物，其中 J 係選自 J-1、J-2、J-3、J-4、J-5、J-7、J-8、J-9、J-10、J-11、J-12、J-14、J-15、J-16、J-20、J-24、J-25、J-26、J-29、J-30、J-37、J-38、J-45 及 J-69。

具體實施例 58. 具體實施例 57 之化合物，其中 J 係選自 J-4、J-5、J-8、J-11、J-15、J-16、J-20、J-29、J-30、J-37、J-38 及 J-69。

具體實施例 59. 具體實施例 58 之化合物，其中 J 係選自

J-4、J-5、J-11、J-20、J-29、J-37、J-38及J-69。

具體實施例 60. 具體實施例 58 之化合物，其中 J 為 J-11。

具體實施例 61. 具體實施例 58 之化合物，其中 J 為 J-29。

具體實施例 61a. 具體實施例 61 之化合物，其中 J 為 J-29-1 至
5 J-29-58 (描繪於附件 A 中)之任一個。

具體實施例 62. 具體實施例 58 之化合物，其中 J 為 J-69。

具體實施例 63. 具體實施例 60 之化合物，其中 J-11 之 3-位置
係連接至 Z^1 ，而 J-11 之 5-位置係連接至不為 H 之 R^5 。

具體實施例 63a. 具體實施例 63 之化合物，其中 J-11 之 3-位
10 置係連接至 Z^1 ，而 J-11 之 5-位置係連接至 Z^2Q 。

連接至 Z^1 且 J-26 之 5-位置係連接至 Z^2Q 。

具體實施例 64. 具體實施例 62 之化合物，其中 J-29 之 3-位置
係連接至 Z^1 ，而 J-29 之 5-位置係連接至不為 H 之 R^5 。

具體實施例 64a. 具體實施例 65 之化合物，其中 J-29 之 3-位
15 置係連接至 Z^1 ，而 J-29 之 5-位置係連接至 Z^2Q 。

具體實施例 65. 式 1 或具體實施例 56 之化合物，其中各 R^5
係獨立為 H、氘基、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、
 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_8 環烷基、
 C_3 - C_8 鹵環烷基、 C_4 - C_{10} 烷基環烷基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷基、
20 C_2 - C_6 烷氧烷基、 C_4 - C_{10} 環烷氧基烷基、 C_3 - C_8 烷氧基烷
氧烷基、 C_2 - C_6 烷基硫基烷基、 C_2 - C_6 烷氧羰基、 C_1 - C_6 烷
氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基、 C_3 - C_8 環烷氧基、 C_3 - C_8 鹵環烷氧
基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 鹵烯基
氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_2 - C_6 鹵炔基氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷

氧基、C₂-C₆烷羰基氧基、C₂-C₆鹵烷基羰基氧基、C₄-C₈環烷基羰基氧基、C₃-C₆烷羰基烷氧基、C₁-C₆烷硫基、C₁-C₆鹵烷硫基、C₃-C₈環烷基硫基、C₃-C₁₀三烷基矽烷基、-NR²⁵R²⁶或Z²Q。

- 5 具體實施例 66. 具體實施例 65 之化合物，其中各 R⁵係獨立為 H、氰基、C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₃-C₈環烷基、C₃-C₈鹵環烷基、C₂-C₆烷氧烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基、C₃-C₈環烷氧基、C₂-C₆烯氧基、C₂-C₆鹵烯基氧基、C₂-C₆炔氧基、C₂-C₆烷氧基烷氧基、C₂-C₆烷羰基氧基、C₂-C₆鹵烷基羰基氧基、C₁-C₆烷硫基、C₁-C₆鹵烷硫基、C₃-C₁₀三烷基矽烷基、-NR²⁵R²⁶或Z²Q。
- 10

具體實施例 67. 具體實施例 66 之化合物，其中各 R⁵係獨立為 H、氰基、C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基、-NR²⁵R²⁶或Z²Q。

- 15 具體實施例 68. 式 1 或具體實施例 56 之化合物，其中 R⁵之一種情況為 Z²Q，而 R⁵之其他情況係獨立選自 H、氰基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵烷基、C₂-C₄烷羰基及鹵素。

具體實施例 69. 具體實施例 68 之化合物，其中 R⁵之其他情況係獨立選自 H 與 C₁-C₃烷基。

- 20 具體實施例 70. 具體實施例 56 之化合物，其中 x 為 1 或 2。

具體實施例 71. 具體實施例 70 之化合物，其中 x 為 1。

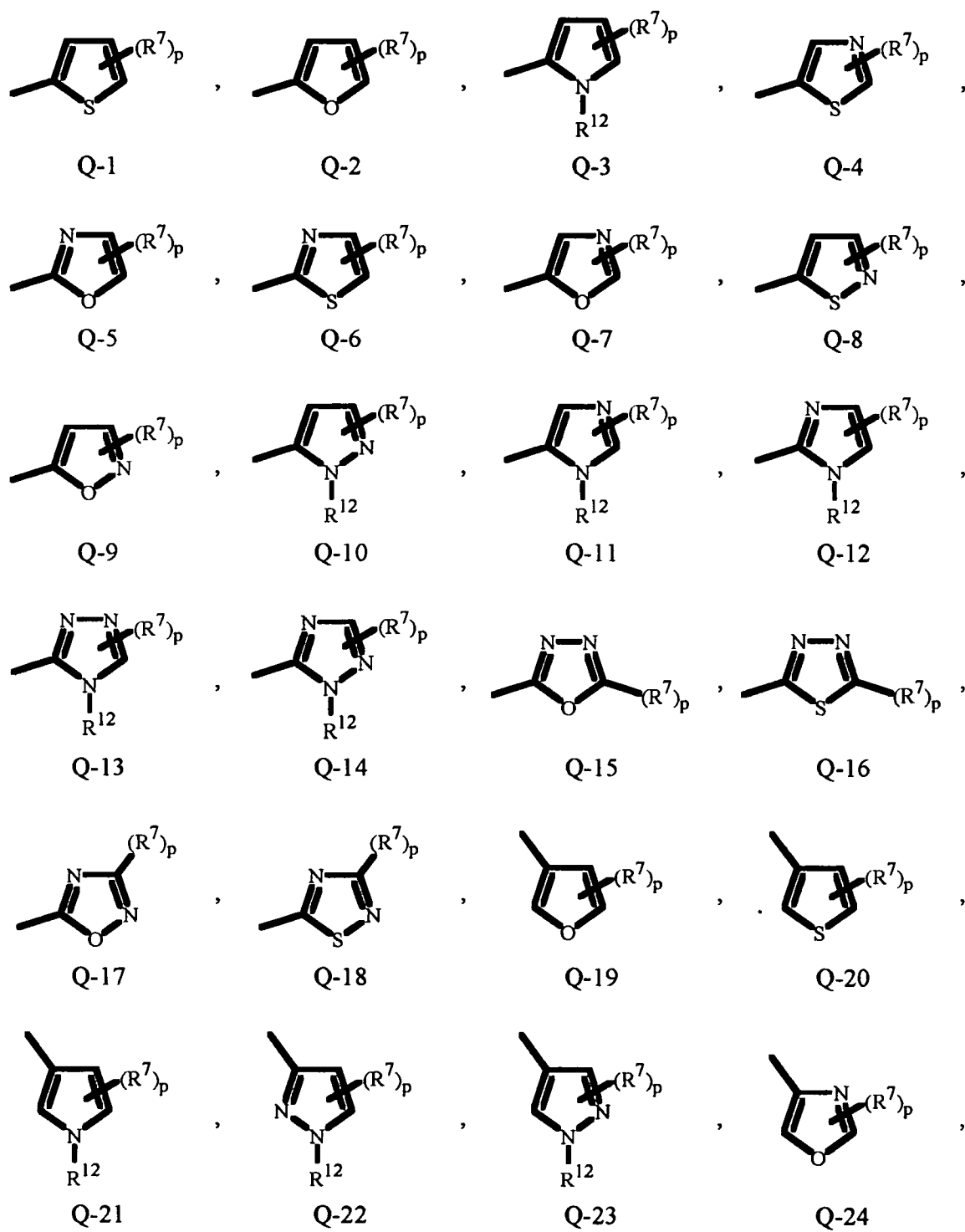
具體實施例 72. 具體實施例 71 之化合物，其中 R⁵為 Z²Q。

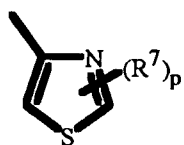
具體實施例 73. 式 1 化合物，其中 Z¹為直接鍵結。

具體實施例 74. 式 1 化合物，其中 Z²為直接鍵結。

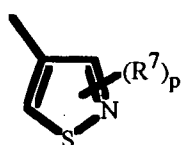
具體實施例 75. 式 1 化合物，其中 Q 為在展示表 4 中所描繪 Q-1 至 Q-102 之一；

展示表 4

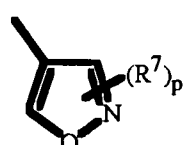




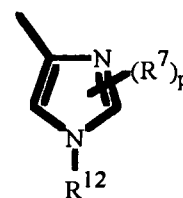
Q-25



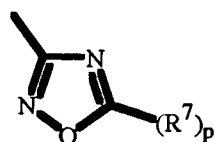
Q-26



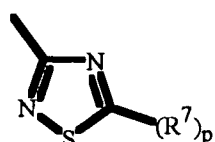
Q-27



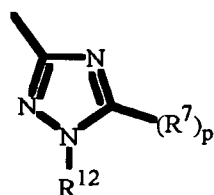
Q-28



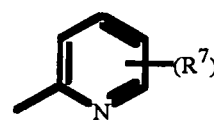
Q-29



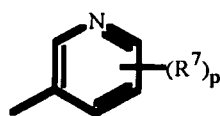
Q-30



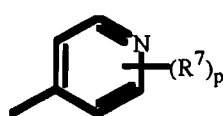
Q-31



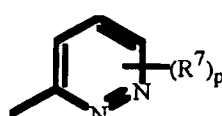
Q-32



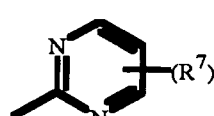
Q-33



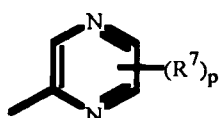
Q-34



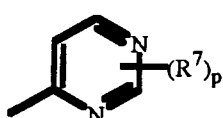
Q-35



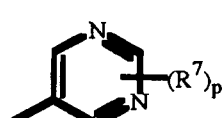
Q-36



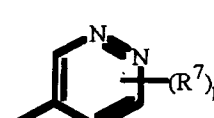
Q-37



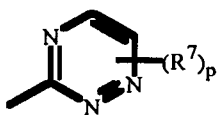
Q-38



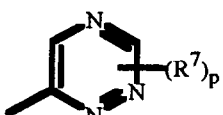
Q-39



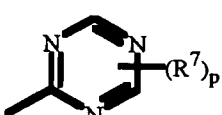
Q-40



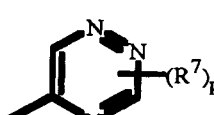
Q-41



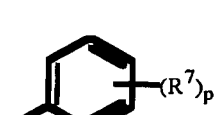
Q-42



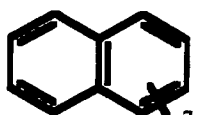
Q-43



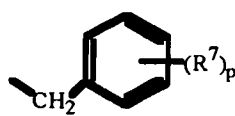
Q-44



Q-45



Q-46



Q-47



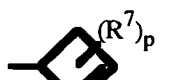
Q-48



Q-49



Q-50



Q-51



Q-52



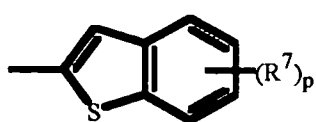
Q-53



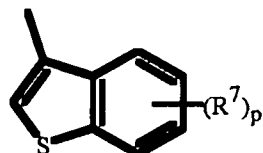
Q-54



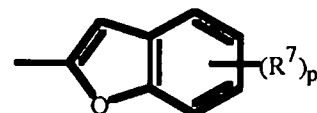
Q-55



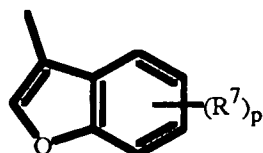
Q-56



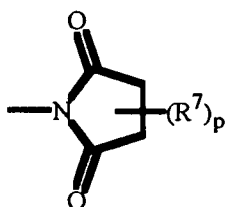
Q-57



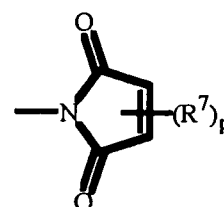
Q-58



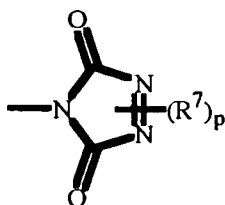
Q-59



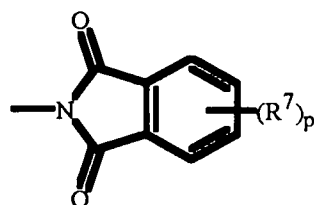
Q-60



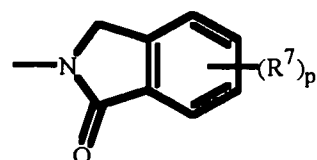
Q-61



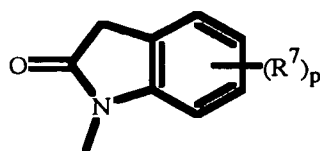
Q-62



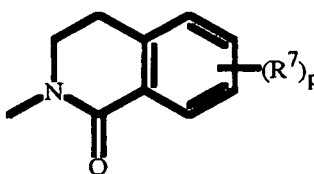
Q-63



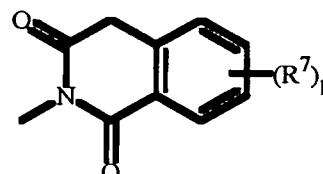
Q-64



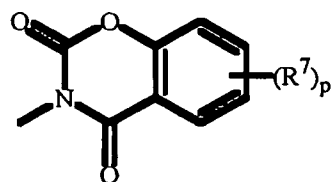
Q-65



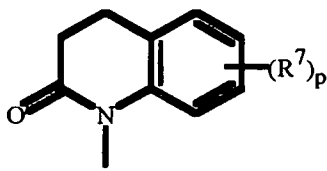
Q-66



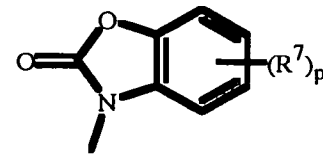
Q-67



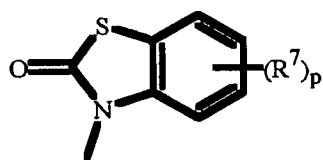
Q-68



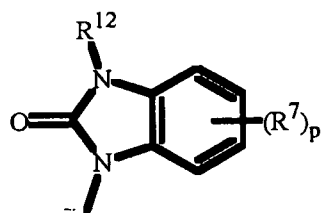
Q-69



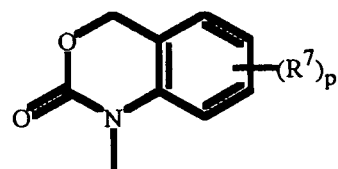
Q-70



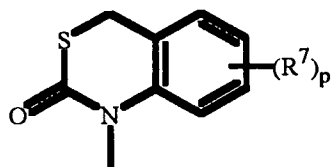
Q-71



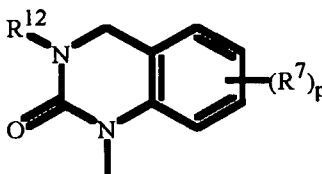
Q-72



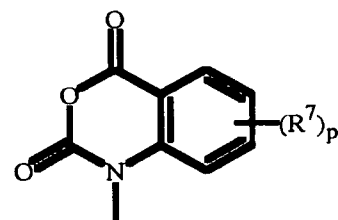
Q-73



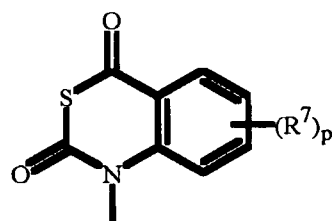
Q-74



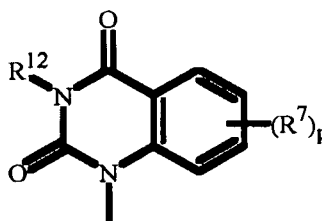
Q-75



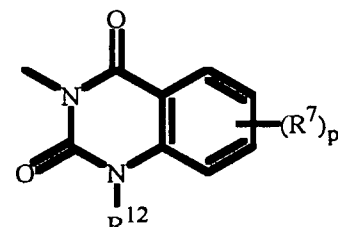
Q-76



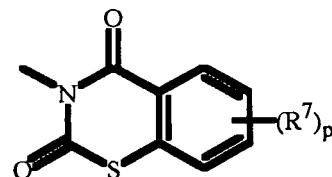
Q-77



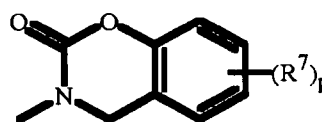
Q-78



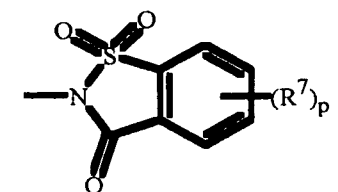
Q-79



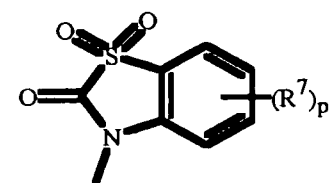
Q-80



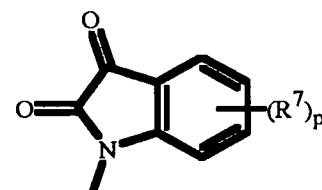
Q-81



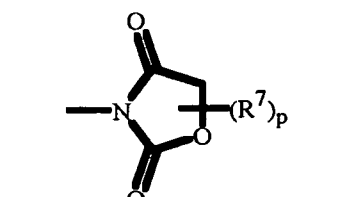
Q-82



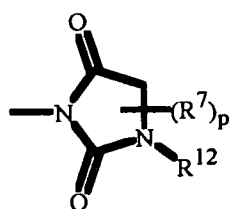
Q-83



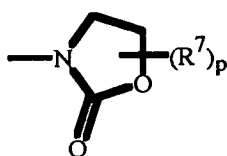
Q-84



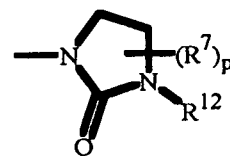
Q-85



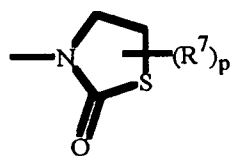
Q-86



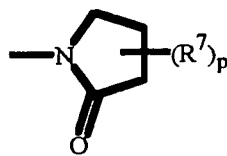
Q-87



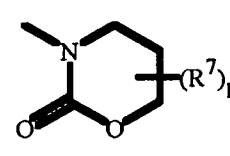
Q-88



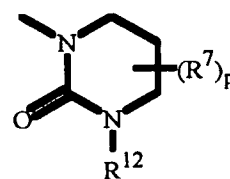
Q-89



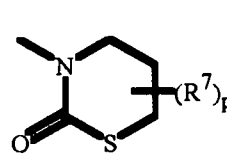
Q-90



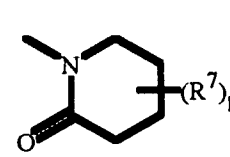
Q-91



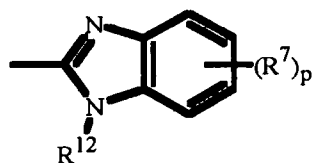
Q-92



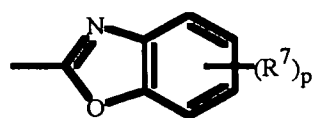
Q-93



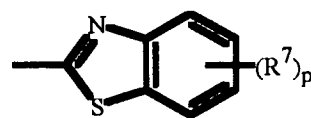
Q-94



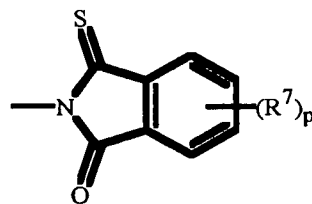
Q-95



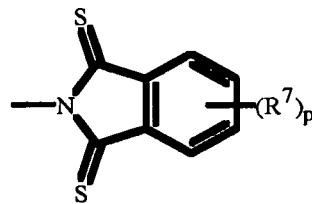
Q-96



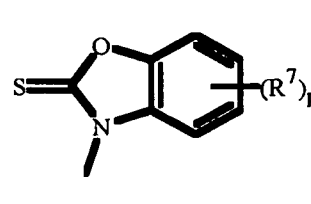
Q-97



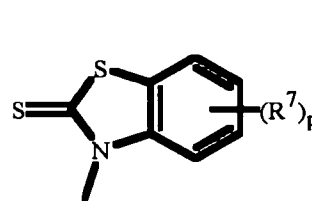
Q-98



Q-99

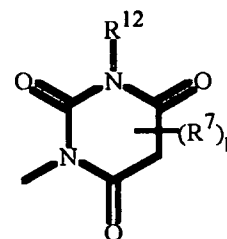


Q-100



Q-101

或



Q-102

其中 p 為 0, 1, 2, 3, 4 或 5。

具體實施例 76. 具體實施例 75 之化合物，其中 Q 係選自 $Q-1$ 、 $Q-20$ 、 $Q-32$ 至 $Q-34$ 、 $Q-45$ 至 $Q-47$ 、 $Q-60$ 至 $Q-73$ 、 $Q-76$

至 Q-79、Q-84 至 Q-94 及 Q-98 至 Q-102。

具體實施例 77. 具體實施例 76 之化合物，其中 Q 為 Q-1、
Q-45、Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、Q-69、Q-70、Q-71、Q-72、
Q-73、Q-76、Q-78、Q-79、Q-84、Q-85、Q-98、Q-99、Q-100、
5 Q-101 或 Q-102。

具體實施例 78. 具體實施例 77 之化合物，其中 Q 為 Q-45、
Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、Q-69、Q-70、Q-71、Q-72 或 Q-85。

具體實施例 78a. 具體實施例 78 之化合物，其中 Q 為 Q-45、
Q-63、Q-65、Q-70、Q-71、Q-72 或 Q-85。

10 具體實施例 78b. 具體實施例 78 之化合物，其中 Q 為 Q-45、
Q-63、Q-65 或 Q-70。

具體實施例 79. 式 1 或具體實施例 75 之化合物，其中各 R^7
係獨立為 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、鹵素、羥基、胺基、
氰基、硝基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基。

15 具體實施例 80. 具體實施例 79 之化合物，其中各 R^7 係獨立
為 C_1 - C_3 烷基、鹵素、羥基、氰基或 C_1 - C_2 烷氧基。

具體實施例 81. 具體實施例 80 之化合物，其中各 R^7 係獨立
為甲基、F、Cl、Br、羥基、氰基或甲氧基。

20 具體實施例 82. 式 1 化合物，其中當 R^5 與 R^7 係和連結 R^5 與
 R^7 之原子一起採用而形成視情況經取代之 5- 至 7-員環
時，環員係選自 2 至 7 個碳原子，及視情況選用之 1 至 3
個雜原子，選自至高 1 個 O，至高 1 個 S，及至高 1 個 N，
且視情況包含 1 至 3 個環員，選自包括 C(=O)、C(=S)、
S(O)、S(O)₂ 及 SiR¹⁷R¹⁸。

具體實施例 82a. 具體實施例 82 之化合物，其中當 R^5 與 R^7 係和連結 R^5 與 R^7 之原子一起採用而形成視情況經取代之 5- 至 7-員環時，則 R^5 與 R^7 係和連結 R^5 與 R^7 之原子一起採用，以形成 5- 至 7-員環，含有作為環員之 2 至 7 個碳原子，及視情況選用之 1 至 3 個雜原子，選自至高 1 個 O，至高 1 個 S，及至高 1 個 N，且視情況包含 1 至 3 個環員，選自包括 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 及 $SiR^{17}R^{18}$ ，視情況被至高 2 個選自 R^8 之取代基取代；且各 R^8 係獨立為 C_1 - C_3 烷基。

具體實施例 82b. 式 1 化合物，其中當 R^5 與 R^7 係和連結 R^5 與 R^7 之原子一起採用而形成視情況經取代之 5- 至 7-員環時，則 R^5 與 R^7 係和連結 R^5 與 R^7 之原子一起採用，以形成 5- 至 7-員環，含有作為環員之 2 至 7 個碳原子，及視情況選用之 1 至 3 個雜原子，選自至高 1 個 O，至高 1 個 S，至高 1 個 Si，及至高 1 個 N，其中該矽原子環原子係選自 $SiR^{17}R^{18}$ ，該環係視情況在連結 R^5 與 R^7 之原子以外之環員上被選自 R^8 之取代基取代；且各 R^8 係獨立為 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷基、 C_4 - C_{10} 烷基環烷基、 C_5 - C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷基磺醯基、 C_1 - C_4 烷胺基、 C_2 - C_8 二烷胺基、 C_3 - C_6 環烷胺基、 C_2 - C_4 烷氧烷基、 C_1 - C_4 羥烷基、

C_2 - C_4 烷羰基、 C_2 - C_6 烷氧羰基、 C_2 - C_6 烷羰基氧基、 C_2 - C_6 烷羰基硫基、 C_2 - C_6 烷胺基羰基、 C_3 - C_8 二烷胺基羰基或
 C_3 - C_6 三烷基矽烷基。

具體實施例 82c. 具體實施例 82b 之化合物，其中環係視情
5 況在連結 R^5 與 R^7 之原子以外之環員上被至高 4 個選自
 R^8 之取代基取代。

具體實施例 82d. 具體實施例 82c 之化合物，其中環係視情
況在連結 R^5 與 R^7 之原子以外之環員上被至高 2 個選自
 R^8 之取代基取代。

10 具體實施例 82e. 具體實施例 82b 之化合物，其中各 R^8 係獨
立為 C_1 - C_3 烷基。

具體實施例 82f. 具體實施例 82b 之化合物，其中當 R^5 與 R^7
係和連結 R^5 與 R^7 之原子一起採用而形成視情況經取代
之 5- 至 7-員環時，則 R^5 與 R^7 係和連結 R^5 與 R^7 之原子一起
15 採用，以形成 5- 至 7-員環，含有作為環員之 2 至 7 個碳原
子，及視情況選用之 1 至 3 個雜原子，選自至高 1 個 O，
至高 1 個 S，及至高 1 個 N，視情況被至高 2 個選自 R^8 之
取代基取代；且各 R^8 為 C_1 - C_3 烷基。

具體實施例 83. 式 1 或具體實施例 75 之化合物，其中 p 為 0,
20 1, 2 或 3。

具體實施例 84. 式 1 化合物，其中 R^1 為視情況經取代之苯
基或 5- 或 6-員雜芳族環。

具體實施例 85. 式 1 化合物，其中 A 為 CH_2 或 NH。

具體實施例 86. 式 1 化合物，其中 X 係選自 X^1 , X^2 , X^3 , X^4 ,

X^5, X^6, X^7 或 X^8 。

具體實施例 87. 式 1 化合物，其中 J 為 5- 或 6-員環、8- 至 11-員雙環狀環系統或 7- 至 11-員螺環狀環系統，各環或環系統含有環員，選自碳及視情況選用之 1 至 3 個雜原子，選自至高 1 個 O，至高 1 個 S，及至高 3 個 N，且視情況包含 1 至 3 個環員，選自包括 C(=O)、C(S)、S(O) 及 S(O)₂，各環或環系統視情況被 1 至 5 個獨立選自 R⁵ 之取代基取代。

具體實施例 88. 式 1 化合物，其中 J 為苯基或 5- 或 6-員雜芳族環或萘基或 8- 至 11-員雜芳族雙環狀環系統，各環或環系統視情況被 1 至 5 個獨立選自 R⁵ 之取代基取代；或 J 為 5-, 6- 或 7-員非芳族環、8- 至 11-員非芳族雙環狀或 7- 至 11-員螺環狀環系統，各環或環系統視情況包含環員，選自包括 C(=O)、C(S)、S(O)、S(O)₂ 及 SiR¹⁷R¹⁸，且視情況被 1 至 5 個獨立選自 R⁵ 之取代基取代。

具體實施例 89. 式 1 化合物，其中各 R⁵ 係獨立為 H、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基、C₂-C₆ 炔基、C₃-C₆ 環烷基、C₄-C₁₀ 環烷基烷基、C₄-C₁₀ 烷基環烷基、C₅-C₁₀ 烷基環烷基烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₂-C₆ 鹵烯基、C₂-C₆ 鹵炔基、C₃-C₆ 鹵環烷基、鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 烷基亞磺醯基、C₁-C₆ 烷基磺醯基、C₁-C₆ 鹵烷硫基、C₁-C₆ 鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₆ 鹵烷基磺醯基、C₁-C₆ 烷胺基、C₂-C₈ 二烷胺基、C₃-C₆ 環烷胺基、C₂-C₆ 烷氧烷基、C₂-C₆ 鹵烷氧基烷基、C₁-C₆

5 羧烷基、C₂-C₆烷羰基、C₂-C₆烷氧羰基、C₂-C₆烷羰基氧
 基、C₂-C₆烷胺基羰基、C₃-C₈二烷胺基羰基、C₃-C₆三烷
 基矽烷基或-Z²Q；各R⁷係獨立為C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、
 C₂-C₆炔基、C₃-C₆環烷基、C₄-C₁₀環烷基烷基、C₄-C₁₀烷
 基環烷基、C₅-C₁₀烷基環烷基烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₂-C₆
 鹵烯基、C₂-C₆鹵炔基、C₃-C₆鹵環烷基、鹵素、羥基、
 胺基、氰基、硝基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄
 烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基、C₁-C₄
 鹵烷硫基、C₁-C₄鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₄鹵烷基磺醯基、
 10 C₁-C₄烷胺基、C₂-C₈二烷胺基、C₃-C₆環烷胺基、C₂-C₄
 烷氧烷基、C₁-C₄羧烷基、C₂-C₄烷羰基、C₂-C₆烷氧羰基、
 C₂-C₆烷羰基氧基、C₂-C₆烷羰基硫基、C₂-C₆烷胺基羰
 基、C₃-C₈二烷胺基羰基或C₃-C₆三烷基矽烷基；或R⁵與
 R⁷係和連結R⁵與R⁷之原子一起採用，以形成視情況經取
 15 代之5-至7-員環，含有作為環員之2至7個碳原子，及視
 情況選用之1至3個雜原子，選自至高1個O，至高1個
 S，及至高1個N。

具體實施例90. 式1化合物，其中各Q係獨立為視情況經取
 代之苯基、苄基、萘基、C₃-C₆環烷基、C₃-C₆環烯基或
 20 5-或6-員雜芳族環，各視情況被1至3個取代基取代，取
 代基選自在碳環員上之R⁷與在氮環員上之R¹²。

具體實施例90a. 式1化合物，其中各Q係獨立為3-至7-員非
 芳族碳環、5-, 6-或7-員非芳族雜環或8-至11-員非芳族雙
 環狀環系統，各視情況包含環員，選自包括C(=O)、

$C(=S)$ 、 $S(O)$ 、 $S(O)_2$ 及 $SiR^{17}R^{18}$ ，且視情況被1至5個取代基取代，取代基獨立選自在碳原子環員上之 R^7 與在氮原子環員上之 R^{12} ；

具體實施例 91. 式1化合物，其中各 Z^1 與 Z^2 係獨立為直接鍵結、 O 、 $C(=O)$ 、 $S(O)_m$ 、 CHR^{20} 或 NR^{21} ；

具體實施例 92. 式1化合物，其中 R^{21} 為 H 、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烷羰基或 C_2 - C_3 烷氧羰基。

具體實施例 93. 式1化合物，其中在式1中，當 G 為視情況經取代之噻唑環，在其2-位置處連接至 X ，且在其4-位置處至 Z^1 ， A 為 CHR^{15} ，且 J 為視情況經取代之異噁唑環，在其4-位置處連接至 Z^1 時，則 Z^1 為 O 、 $C(=O)$ 、 $S(O)_m$ 、 CHR^{20} 或 NR^{21} 。

具體實施例 94. 式1化合物，其中在式1中，當 G 為視情況經取代之噻唑環，在其2-位置處連接至 X ，且在其4-位置處至 Z^1 ，且 J 為視情況經取代之異噁唑環，在其4-位置處連接至 Z^1 時，則 Z^1 為 O 、 $C(=O)$ 、 $S(O)_m$ 、 CHR^{20} 或 NR^{21} 。

具體實施例 95. 式1化合物，其中在式1中，當 G 為視情況經取代之噻唑環，在其2-位置處連接至 X ，且在其4-位置處至 Z^1 ， A 為 CHR^{15} ， Z^1 為直接鍵結，且 J 為視情況經取代之異噁唑環時，則 J 係在異噁唑環之3-或5-位置處連接至式1之其餘部份。

具體實施例 96. 式1化合物，其中在式1中，當 G 為視情況經取代之噻唑環，在其2-位置處連接至 X ，且在其4-位

置處至 Z^1 ，A 為 CHR^{15} ， Z^1 為直接鍵結，且 J 為視情況經取代之異噁唑環時，則 J 係在異噁唑環之 3-位置處連接至式 1 之其餘部份。

5 具體實施例 97. 式 1 化合物，其中在式 1 中，當 G 為視情況經取代之噻唑環，在其 2-位置處連接至 X，且在其 4-位置處至 Z^1 ， Z^1 為直接鍵結，且 J 為視情況經取代之異噁唑環時，則 J 係在異噁唑環之 3-位置處連接至式 1 之其餘部份。

10 具體實施例 98. 式 1 化合物，其中當 X 為 X^2 ，且含有 X 之環為飽和，A 為 CHR^{15} ，G 為視情況經取代之 5-員雜芳族環， Z^1 為直接鍵結，且 J 為苯基或 5-或 6-員雜芳族環或萘基或 8-至 11-員雜芳族雙環狀環系統時，則 J 環或環系統係被至少一個不為 H 之 R^5 取代。

15 具體實施例 99. 式 1 化合物，其中當 X 為 X^2 ，且含有 X 之環為飽和，A 為 CHR^{15} ，G 為視情況經取代之 5-員雜芳族環， Z^1 為直接鍵結，且 J 為苯基或 5-或 6-員雜芳族環或萘基或 8-至 11-員雜芳族雙環狀環系統時，則 J 環或環系統係被至少一個作為 Z^2Q 之 R^5 取代。

20 具體實施例 100. 式 1 化合物，其中當 X 為 X^1 ，且含有 X 之環為飽和，A 為 NH，在式 1 中，G 為視情況經取代之噻唑環，在其 2-位置處連接至 X，且在其 4-位置處至 Z^1 ，且 J 為視情況經取代之咪唑環，在其 2-位置處連接至式 1 之其餘部份時，則 Z^1 為 O、C(=O)、S(O)_m、 CHR^{20} 或 NR^{21} 。

具體實施例 101. 式 1 化合物，其中當 X 為 X^1 ，且含有 X 之

環為飽和，A為 NR^{16} ，在式1中，G為視情況經取代之噻唑環，在其2-位置處連接至X，且在其4-位置處至 Z^1 ，且J為視情況經取代之咪唑環，在其2-位置處連接至式1之其餘部份時，則 Z^1 為O、 C(=O) 、 S(O)_m 、 CHR^{20} 或 NR^{21} 。

5 具體實施例 102. 式1化合物，其中在式1中，當G為視情況經取代之噻唑環，在其2-位置處連接至X，且在其4-位置處至 Z^1 時，則J不為視情況經取代之咪唑基。

具體實施例 103. 式1化合物，其中各 Z^4 係獨立為 C(=O) 或 S(O)_2 。

10 具體實施例 104. 具體實施例 103 之化合物，其中各 Z^4 為 C(=O) 。

具體實施例 105. 式1化合物，其中

各 R^2 係獨立為 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烯基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、鹵素、氰基或羥基；或

15 兩個 R^2 係一起採用為 C_1 - C_3 次烷基或 C_2 - C_3 次烯基，以形成經橋接之雙環狀環系統；或

連接至藉由雙鍵接合之鄰近環碳原子之兩個 R^2 係一起採用為 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ ，視情況被1至3個選自 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、鹵素、羥基、胺基、氰基及硝基之取代基取代。

20

具體實施例 1-105 之組合係藉由以下說明：

具體實施例 A1. 式1化合物，其中

G為5-員雜芳族環或5-員飽和或部份飽和雜環，各環視情況被至高2個取代基取代，取代基選自在碳環員

上之 R^3 ，及選自在氮環員上之 R^{11} ；

R^1 為苯基或 5- 或 6-員雜芳族環，視情況被 1 至 2 個取代基取代，取代基獨立選自在碳環員上之 R^{4a} 與在氮環員上之 R^{4b} ；

5 各 R^2 係獨立為 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基、鹵素、氰基或羥基；

各 R^3 係獨立為 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基或鹵素；

各 R^{4a} 係獨立為 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷基、 C_4 - C_{10} 烷基環烷基、
 10 C_5 - C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、鹵素、羥基、胺基、
 15 氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯基、
 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷基磺醯基、 C_1 - C_4 烷胺基、 C_2 - C_8 二烷胺基、 C_3 - C_6 環
 20 烷胺基、 C_2 - C_4 烷氧烷基、 C_1 - C_4 羥烷基、 C_2 - C_4 烷羰基、 C_2 - C_6 烷氧羰基、 C_2 - C_6 烷羰基氧基、 C_2 - C_6 烷羰基硫基、 C_2 - C_6 烷胺基羰基、 C_3 - C_8 二烷胺基羰基或
 C_3 - C_6 三烷基矽烷基；

20 各 R^{4b} 係獨立為 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_6 烯基、 C_3 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_3 - C_6 鹵烯基、 C_3 - C_6 鹵炔基、
 C_3 - C_6 鹵環烷基或 C_2 - C_4 烷氧烷基；

各 R^{11} 係獨立為 C_1 - C_3 烷基；

R^{15} 為 H、鹵素、氰基、羥基、-CHO、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4

鹵烷基或 C_2 - C_5 烷氧羰基；

R^{16} 為 H、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烷羰基、 C_2 - C_4

鹵烷基羰基或 C_2 - C_4 烷氧羰基；

當 R^5 與 R^7 係和連結 R^5 與 R^7 之原子一起採用而形成視情

況經取代之 5- 至 7-員環時，則 R^5 與 R^7 係和連結 R^5 與

R^7 之原子一起採用，以形成 5- 至 7-員環，含有作為

環員之 2 至 7 個碳原子，及視情況選用之 1 至 3 個雜

原子，選自至高 1 個 O，至高 1 個 S，及至高 1 個 N，

且視情況包含 1 至 3 個環員，選自包括 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、

$S(O)$ 、 $S(O)_2$ 及 $SiR^{17}R^{18}$ ，該環視情況在連結 R^5 與 R^7

之原子以外之環員上被至高 4 個選自 R^8 之取代基取

代；

各 R^8 係獨立為 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6

環烷基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷基、 C_4 - C_{10} 烷基環烷基、

C_5 - C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯基、

C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、鹵素、羥基、胺基、

氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4

烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯基、

C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷

基磺醯基、 C_1 - C_4 烷胺基、 C_2 - C_8 二烷胺基、 C_3 - C_6 環

烷胺基、 C_2 - C_4 烷氧烷基、 C_1 - C_4 羥烷基、 C_2 - C_4 烷羰

基、 C_2 - C_6 烷氧羰基、 C_2 - C_6 烷羰基氧基、 C_2 - C_6 烷羰

基硫基、 C_2 - C_6 烷胺基羰基、 C_3 - C_8 二烷胺基羰基或

C_3 - C_6 三烷基矽烷基；且

各 Z^4 係獨立為 $C(=O)$ 或 $S(O)_2$ 。

具體實施例 A2. 具體實施例 A1 之化合物，其中

G 為 G-1 至 G-59 (如展示表 2 中所描繪) 之一，其中凸出至左邊之鍵結係結合至 X，而凸出至右邊之鍵結係結合至 Z^1 ；

J 為 J-1 至 J-82 (如展示表 3 中所描繪) 之一，其中所顯示凸出至左邊之鍵結係結合至 Z^1 ；

Q 為 Q-1 至 Q-102 (如展示表 4 中所描繪) 之一；

R^1 為 U-1 至 U-50 (如展示表 1 中所描繪) 之一；

各 R^2 係獨立為甲基、甲氧基、氰基或羥基；

各 R^{3a} 係獨立選自 H 或 R^3 ；

各 R^5 係獨立為 H、氰基、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_8 環烷基、 C_3 - C_8 鹵環烷基、 C_4 - C_{10} 烷基環烷基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷基、 C_2 - C_6 烷氧烷基、 C_4 - C_{10} 環烷氧基烷基、 C_3 - C_8 烷氧基烷氧烷基、 C_2 - C_6 烷基硫基烷基、 C_2 - C_6 烷氧羰基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基、 C_3 - C_8 環烷氧基、 C_3 - C_8 鹵環烷氧基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 鹵烯基氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_2 - C_6 鹵炔基氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷氧基、 C_2 - C_6 烷羰基氧基、 C_2 - C_6 鹵烷基羰基氧基、 C_4 - C_8 環烷基羰基氧基、 C_3 - C_6 烷羰基烷氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 鹵烷硫基、 C_3 - C_8 環烷基硫基、 C_3 - C_{10} 三烷基矽烷基、 $-NR^{25}R^{26}$ 或 Z^2Q ；

R^{11a} 係選自H或 R^{11} ；

R^{15} 為H、氰基、羥基、甲基或甲氧羰基；

R^{16} 為H、甲基、甲基羰基或甲氧羰基；

各 Z^4 為C(=O)；

5 k 為0、1或2；

p 為0、1、2或3；且

x 為0至5之整數；

其條件是：

(a) 當 R^4 連接至碳環員時，該 R^4 係選自 R^{4a} ；

10 (b) 當 R^4 連接至氮環員(例如在U-4、U-11至U-15、U-24至U-26、U-31或U-35中)時，該 R^4 係選自 R^{4b} ；

(c) 當 G 為G-6、G-16或G-42，且各 R^{3a} 不為H時，則 R^{11a} 為H；

(d) 當 G 為G-25或G-31時，則至少一個 R^{3a} 為H；及

15 (e) 當 G 為G-31至G-35之一時，則 Z^1 為直接鍵結或 CHR^{20} 。

具體實施例A3. 具體實施例A2之化合物，其中

G 係選自G-1、G-2、G-7、G-8、G-14、G-15、G-23、G-24、
G-26、G-27、G-36、G-37、G-38、G-49、G-50及G-55；

20 J 係選自J-1、J-2、J-3、J-4、J-5、J-7、J-8、J-9、J-10、
J-11、J-12、J-14、J-15、J-16、J-20、J-24、J-25、J-26、
J-29、J-30、J-37、J-38、J-45及J-69；

各 Q 係獨立為Q-1、Q-20、Q-32至Q-34、Q-45至Q-47、Q-60
至Q-73、Q-76至Q-79、Q-84至Q-94及Q-98至Q-102；

A 為 CH_2 或 NH ;

W 為 O ;

X 為 X^1 、 X^2 或 X^3 ;

各 R^5 係獨立為 H、氰基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_3 - C_8

5 環烷基、 C_3 - C_8 鹵環烷基、 C_2 - C_6 烷氧烷基、 C_1 - C_6 烷
氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基、 C_3 - C_8 環烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧
基、 C_2 - C_6 鹵烯基氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_2 - C_6 烷氧基
烷氧基、 C_2 - C_6 烷羰基氧基、 C_2 - C_6 鹵烷基羰基氧基、
 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 鹵烷硫基、 C_3 - C_{10} 三烷基矽烷
10 基、 $-\text{NR}^{25}\text{R}^{26}$ 或 Z^2Q ;

Z^1 為直接鍵結 ;

Z^2 為直接鍵結或 NR^{21} ;

R^1 係選自 U-1 至 U-3、U-11、U-13、U-20、U-22、U-23、
U-36 至 U-39 及 U-50 ;

15 各 R^3 係獨立為甲基或鹵素 ;

各 R^{4a} 係獨立為 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、鹵素、 C_1 - C_2
烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基 ;

各 R^{4b} 係獨立為 C_1 - C_2 烷基或 C_1 - C_2 鹵烷基 ;

各 R^7 係獨立為鹵素、氰基、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、

20 羥基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基 ;

k 為 1 或 2 ; 且

n 為 0 。

值得注意的是具體實施例 A3 化合物，其中一個 R^5 為 Z^2Q ，
而任何其他 R^5 取代基係獨立選自 H、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷

基、C₃-C₈環烷基、C₃-C₈鹵環烷基、C₂-C₆烷氧烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基、C₃-C₈環烷氧基、C₂-C₆烯氧基、C₂-C₆鹵烯基氧基、C₂-C₆炔氧基、C₂-C₆烷氧基烷氧基、C₂-C₆烷羰基氧基、C₂-C₆鹵烷基羰基氧基、C₁-C₆烷硫基、C₁-C₆鹵烷硫基、C₃-C₁₀三烷基矽烷基及-NR²⁵R²⁶。亦值得注意的是具體實施例 A3 化合物，其中全部 R⁵ 取代基係不為 Z²Q (例如各 R⁵ 係獨立選自 H、C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₃-C₈環烷基、C₃-C₈鹵環烷基、C₂-C₆烷氧烷基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基、C₃-C₈環烷氧基、C₂-C₆烯氧基、C₂-C₆鹵烯基氧基、C₂-C₆炔氧基、C₂-C₆烷氧基烷氧基、C₂-C₆烷羰基氧基、C₂-C₆鹵烷基羰基氧基、C₁-C₆烷硫基、C₁-C₆鹵烷硫基、C₃-C₁₀三烷基矽烷基及-NR²⁵R²⁶)。

具體實施例 A4. 具體實施例 A3 之化合物，其中

A 為 CH₂；

G 係選自 G-1、G-2、G-15、G-26、G-27、G-36、G-37 及 G-38；

且 G 為未經取代；

J 係選自 J-4、J-5、J-8、J-11、J-15、J-16、J-20、J-29、J-30、J-37、J-38 及 J-69；

Q 係選自 Q-1、Q-45、Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、Q-69、Q-70、Q-71、Q-72、Q-73、Q-76、Q-78、Q-79、Q-84、Q-85、Q-98、Q-99、Q-100、Q-101 或 Q-102；

X 為 X¹ 或 X²；且包含 X 之環為飽和；

R¹ 為 U-1 或 U-50；

各 R^{4a} 係獨立為 C₁-C₂ 烷基、三氟甲基、Cl、Br、I 或甲氧

基；

各 R^{4b} 係獨立為 C_1 - C_2 烷基或三氟甲基；且

各 R^5 係獨立為 H、氰基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基、 $-NR^{25}R^{26}$ 或 Z^2Q 。

5 具體實施例 A5. 具體實施例 A4 之化合物，其中

G 係選自 G-1、G-2、G-15、G-26 及 G-36；

J 係選自 J-4、J-5、J-11、J-20、J-29、J-37、J-38 及 J-69；

Q 係選自 Q-45、Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、Q-69、Q-70、
Q-71、Q-72 及 Q-85；且

10 X 為 X^1 。

具體實施例 A6. 式 1 化合物，其中

R^1 為視情況經取代之苯基或 5- 或 6- 員雜芳族環；

A 為 CH_2 或 NH；

X 為 X^1 , X^2 , X^3 , X^4 , X^5 , X^6 , X^7 或 X^8 ；

15 各 R^2 係獨立為 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烯基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、鹵素、氰基或羥基；或

兩個 R^2 係一起採用為 C_1 - C_3 次烷基或 C_2 - C_3 次烯基，以形成經橋接之雙環狀環系統；或

連接至藉由雙鍵接合之鄰近環碳原子之兩個 R^2 係一起

20 採用為 $-CH=CH-CH=CH-$ ，視情況被 1 至 3 個取代基取代，取代基選自 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、鹵素、羥基、胺基、氰基及硝基；

G 為視情況經取代之 5- 員雜芳族環或 5- 員飽和或部份飽

和雜環；

J 為 5- 或 6-員環或 8- 至 11-員雙環狀環系統，各環或環系統含有環員，選自碳及視情況選用之 1 至 3 個雜原子，選自至高 1 個 O，至高 1 個 S，及至高 3 個 N，且視情況包含 1 至 3 個環員，選自包括 C(=O)、C(=S)、S(O) 或 S(O)₂，各環或環系統視情況被 1 至 5 個獨立選自 R⁵ 之取代基取代；

各 R⁵ 係獨立為 H、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基、C₂-C₆ 炔基、C₃-C₆ 環烷基、C₄-C₁₀ 環烷基烷基、C₄-C₁₀ 烷基環烷基、C₅-C₁₀ 烷基環烷基烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₂-C₆ 鹵烯基、C₂-C₆ 鹵炔基、C₃-C₆ 鹵環烷基、鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 烷基亞磺醯基、C₁-C₆ 烷基磺醯基、C₁-C₆ 鹵烷硫基、C₁-C₆ 鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₆ 鹵烷基磺醯基、C₁-C₆ 烷胺基、C₂-C₈ 二烷胺基、C₃-C₆ 環烷胺基、C₂-C₆ 烷氧烷基、C₂-C₆ 鹵烷氧基烷基、C₁-C₆ 羥烷基、C₂-C₆ 烷羰基、C₂-C₆ 烷氧羰基、C₂-C₆ 烷羰基氧基、C₂-C₆ 烷胺基羰基、C₃-C₈ 二烷胺基羰基、C₃-C₆ 三烷基矽烷基或 -Z²Q；

各 Q 係獨立為視情況經取代之苯基、苣基、萘基、C₃-C₆ 環烷基、C₃-C₆ 環烯基或 5- 或 6-員雜芳族環，各視情況被 1 至 3 個取代基取代，取代基選自在碳環員上之 R⁷ 與在氮環員上之 R¹²；

各 R⁷ 係獨立為 C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基、C₂-C₆ 炔基、C₃-C₆

環烷基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷基、 C_4 - C_{10} 烷基環烷基、
 C_5 - C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯
 基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、鹵素、羥基、
 5 胺基、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、
 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯
 基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4
 鹵烷基磺醯基、 C_1 - C_4 烷胺基、 C_2 - C_8 二烷胺基、 C_3 - C_6
 環烷胺基、 C_2 - C_4 烷氧烷基、 C_1 - C_4 羥烷基、 C_2 - C_4 烷
 羰基、 C_2 - C_6 烷氧羰基、 C_2 - C_6 烷羰基氧基、 C_2 - C_6 烷
 10 羰基硫基、 C_2 - C_6 烷胺基羰基、 C_3 - C_8 二烷胺基羰基
 或 C_3 - C_6 三烷基矽烷基；或

R^5 與 R^7 係和連結 R^5 與 R^7 之原子一起採用，以形成視情況
 經取代之5-至7員環，含有作為環員之2至7個碳原
 子，及視情況選用之1至3個雜原子，選自至高1個
 15 O，至高1個S，及至高1個N；

R^{12} 為 C_1 - C_3 烷基；

各 Z^1 與 Z^2 係獨立為直接鍵結、O、 $S(O)_m$ 、 CHR^{20} 或 NR^{21} ；

且

R^{21} 為H或 C_1 - C_3 烷基。

20 具體實施例A7. 具體實施例A6之化合物，其中

G為5-員雜芳族環或5-員飽和或部份飽和雜環，各環視
 情況被至高2個取代基取代，取代基選自在碳環員
 上之 R^3 ，及選自在氮環員上之 R^{11} ；

R^1 為苯基或5-或6-員雜芳族環，視情況被1至2個取代基

取代，取代基獨立選自在碳環員上之 R^{4a} 與在氮環員上之 R^{4b} ；

各 R^3 係獨立為 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基或鹵素；

各 R^{4a} 係獨立為 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷基、 C_4 - C_{10} 烷基環烷基、 C_5 - C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷基磺醯基、 C_1 - C_4 烷胺基、 C_2 - C_8 二烷胺基、 C_3 - C_6 環烷胺基、 C_2 - C_4 烷氧烷基、 C_1 - C_4 羥烷基、 C_2 - C_4 烷羰基、 C_2 - C_6 烷氧羰基、 C_2 - C_6 烷羰基氧基、 C_2 - C_6 烷羰基硫基、 C_2 - C_6 烷胺基羰基、 C_3 - C_8 二烷胺基羰基或 C_3 - C_6 三烷基矽烷基；

各 R^{4b} 係獨立為 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_6 烯基、 C_3 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_3 - C_6 鹵烯基、 C_3 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基或 C_2 - C_4 烷氧烷基；

各 R^{11} 係獨立為 C_1 - C_3 烷基；且

當 R^5 與 R^7 係和連結 R^5 與 R^7 之原子一起採用而形成視情況經取代之5-至7-員環時，則 R^5 與 R^7 係和連結 R^5 與 R^7 之原子一起採用，以形成5-至7-員環，含有作為環員之2至7個碳原子，及視情況選用之1至3個雜原子，選自至高1個O，至高1個S，及至高1個N，

視情況被至高2個選自 R^8 之取代基取代；且各 R^8 係獨立為 C_1 - C_3 烷基。

具體實施例A8. 具體實施例A7之化合物，其中

G為G-1至G-55(如展示表2中所描繪)之一，其中凸出至左邊之鍵結係結合至X，而凸出至右邊之鍵結係結合至 Z^1 ；

J為J-1至J-82(如展示表3中所描繪)之一，其中所顯示凸出至左邊之鍵結係結合至 Z^1 ；

Q為Q-1至Q-55(如展示表4中所描繪)之一；

R^1 為U-1至U-50(如展示表1中所描繪)之一；

各 R^{3a} 係獨立選自H或 R^3 ；

R^{11a} 係選自H或 R^{11} ；

k為0、1或2；

p為0、1或2；且

x為0至5之整數；

其條件是：

(a) 當 R^4 連接至碳環員時，該 R^4 係選自 R^{4a} ；

(b) 當 R^4 連接至氮環員(例如在U-4、U-11至U-15、U-24至U-26、U-31或U-35中)時，該 R^4 係選自 R^{4b} ；

(c) 當G為G-6、G-16或G-42，且各 R^{3a} 不為H時，則 R^{11a} 為H；

(d) 當G為G-25或G-31時，則至少一個 R^{3a} 為H；及

(e) 當G為G-31至G-35之一時，則 Z^1 為直接鍵結或 CHR^{20} 。

具體實施例 A9. 具體實施例 A8 之化合物，其中

G 係選自 G-1、G-2、G-15、G-26、G-27、G-36、G-37 及 G-38；

J 係選自 J-1、J-2、J-3、J-4、J-5、J-7、J-8、J-9、J-10、

J-11、J-12、J-14、J-15、J-16、J-20、J-24、J-25、J-26、

J-29、J-30、J-45 及 J-69；

各 Q 係獨立為 Q-1、Q-20、Q-32 至 34、Q-45、Q-46 或 Q-47；

W 為 O；

X 為 X^1 、 X^2 或 X^3 ；

各 Z^1 與 Z^2 為直接鍵結。

R^1 係選自 U-1 至 U-3、U-11、U-13、U-20、U-22、U-23、

U-36 至 U-39 及 U-50；

各 R^3 係獨立為甲基或鹵素；

各 R^{4a} 係獨立為 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、鹵素或 C_1 - C_2

烷氧基；

各 R^{4b} 係獨立為 C_1 - C_2 烷基或 C_1 - C_2 鹵烷基；

R^5 之一種情況為 Z^2Q ，而 R^5 之其他情況係獨立選自 H、

C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基及鹵素；

各 R^7 係獨立為鹵素、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、羥基、

C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基；

k 為 1 或 2；且

n 為 0。

具體實施例 A10. 具體實施例 A9 之化合物，其中

A 為 CH_2 ；

G 係選自 G-1、G-2、G-15、G-26 及 G-36；且 G 為未經取代；

J 係選自 J-11、J-25、J-26、J-29 或 J-30；

Q 係選自 Q-1 或 Q-45；

X 為 X^1 或 X^2 ；且包含 X 之環為飽和；

R^1 為 U-1 或 U-50；

5 各 R^{4a} 係獨立為 C_1 - C_2 烷基、三氟甲基、Cl、Br、I 或甲氧基；且

各 R^{4b} 係獨立為 C_1 - C_2 烷基或三氟甲基。

具體實施例 A11. 具體實施例 A10 之化合物，其中

J 係選自 J-11 與 J-29。

10 X 為 X^1 ；且

各 R^{4a} 係獨立為 C_1 - C_2 烷基、三氟甲基或 Cl。

具體實施例 A12. 式 1 化合物，其中

R^1 為 U-1 或 U-50 (如展示表 1 中所描繪)，其中當 R^4 連接至碳環員時，該 R^4 係選自 R^{4a} ，而當 R^4 連接至氮環員時，

15 該 R^4 係選自 R^{4b} ；

各 R^{4a} 係獨立為 C_1 - C_2 烷基、三氟甲基、Cl、Br、I 或甲氧基；

各 R^{4b} 係獨立為 C_1 - C_2 烷基或三氟甲基；

A 為 CH_2 ；

20 W 為 O；

X 為 X^1 或 X^2 ，且包含 X 之環為飽和；

各 R^2 係獨立為乙基、甲氧基、氰基或羥基；

G 係選自 G-1、G-2、G-15、G-26 及 G-36 (如展示表 2 中所描繪)，其中凸出至左邊之鍵結係結合至 X，而凸出

至右邊之鍵結係結合至 Z^1 ；且 G 為未經取代；

各 R^{3a} 係獨立選自 H 或 R^3 ；

各 R^3 係獨立為甲基或鹵素；

J 係選自 J-11、J-25、J-26、J-29 或 J-30 (如展示表 3 中所描
繪)；其中所顯示凸出至左邊之鍵結係結合至 Z^1 ；

各 R^5 係獨立為 H、鹵素、氰基、羥基、胺基、硝基、-CHO、
-C(=O)OH、-C(=O)NH₂、-NR²⁵R²⁶、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆
烯基、C₂-C₆ 炔基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₂-C₆ 鹵烯基、C₂-C₆
鹵炔基、C₃-C₈ 環烷基、C₃-C₈ 鹵環烷基、C₄-C₁₀ 烷基
環烷基、C₄-C₁₀ 環烷基烷基、C₆-C₁₄ 環烷基環烷基、
C₄-C₁₀ 鹵環烷基烷基、C₅-C₁₀ 烷基環烷基烷基、C₃-C₈
環烯基、C₃-C₈ 鹵環烯基、C₂-C₆ 烷氧烷基、C₄-C₁₀ 環
烷氧基烷基、C₃-C₈ 烷氧基烷氧烷基、C₂-C₆ 烷基硫
基烷基、C₂-C₆ 烷基亞磺醯基烷基、C₂-C₆ 烷基磺醯
基烷基、C₂-C₆ 烷胺基烷基、C₃-C₈ 二烷胺基烷基、
C₂-C₆ 鹵烷基胺基烷基、C₄-C₁₀ 環烷胺基烷基、C₂-C₆
烷羰基、C₂-C₆ 鹵烷基羰基、C₄-C₈ 環烷基羰基、C₂-C₆
烷氧羰基、C₄-C₈ 環烷氧基羰基、C₅-C₁₀ 環烷基烷氧
羰基、C₂-C₆ 烷胺基羰基、C₃-C₈ 二烷胺基羰基、C₄-C₈
環烷胺基羰基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、C₃-C₈
環烷氧基、C₃-C₈ 鹵環烷氧基、C₄-C₁₀ 環烷基烷氧基、
C₂-C₆ 烯氧基、C₂-C₆ 鹵烯基氧基、C₂-C₆ 炔氧基、C₂-C₆
鹵炔基氧基、C₂-C₆ 烷氧基烷氧基、C₂-C₆ 烷羰基氧
基、C₂-C₆ 鹵烷基羰基氧基、C₄-C₈ 環烷基羰基氧基、

C₃-C₆烷羰基烷氧基、C₁-C₆烷硫基、C₁-C₆鹵烷硫基、
C₃-C₈環烷基硫基、C₁-C₆烷基亞磺醯基、C₁-C₆鹵烷
基亞磺醯基、C₁-C₆烷基磺醯基、C₁-C₆鹵烷基磺醯
基、C₃-C₈環烷基磺醯基、C₃-C₁₀三烷基矽烷基、C₁-C₆
5 烷基磺醯基胺基、C₁-C₆鹵烷基磺醯基胺基或-Z²Q；

R²⁵為H、C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₃-C₈環烷基、C₂-C₆
烷羰基、C₂-C₆鹵烷基羰基、C₂-C₆烷氧羰基或C₂-C₆
鹵烷氧基羰基；

R²⁶為C₁-C₆烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₃-C₈環烷基、C₂-C₆烷
10 羰基、C₂-C₆鹵烷基羰基、C₂-C₆烷氧羰基、C₂-C₆鹵
烷氧基羰基或-Z⁴Q；

各Q係選自Q-1、Q-45或Q-63(如展示表4中所描繪)；

各R⁷係獨立為C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆
環烷基、C₄-C₁₀環烷基烷基、C₄-C₁₀烷基環烷基、
15 C₅-C₁₀烷基環烷基烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₂-C₆鹵烯基、
C₂-C₆鹵炔基、C₃-C₆鹵環烷基、鹵素、羥基、胺基、
氰基、硝基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄
烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基、
C₁-C₄鹵烷硫基、C₁-C₄鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₄鹵烷
20 基磺醯基、C₁-C₄烷胺基、C₂-C₈二烷胺基、C₃-C₆環
烷胺基、C₂-C₄烷氧烷基、C₁-C₄羥烷基、C₂-C₄烷羰
基、C₂-C₆烷氧羰基、C₂-C₆烷羰基氧基、C₂-C₆烷羰
基硫基、C₂-C₆烷胺基羰基、C₃-C₈二烷胺基羰基或
C₃-C₆三烷基矽烷基；或

R^5 與 R^7 係和連結 R^5 與 R^7 之原子一起採用，以形成 5- 至 7- 員環，含有作為環員之 2 至 7 個碳原子，及視情況選用之 1 至 3 個雜原子，選自至高 1 個 O，至高 1 個 S，至高 1 個 Si，及至高 1 個 N，該環視情況在連結 R^5 與 R^7 之原子以外之環員上被至高 4 個選自 R^8 之取代基取代；

各 R^8 係獨立為 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷基、 C_4 - C_{10} 烷基環烷基、 C_5 - C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷基磺醯基、 C_1 - C_4 烷胺基、 C_2 - C_8 二烷胺基、 C_3 - C_6 環烷胺基、 C_2 - C_4 烷氧烷基、 C_1 - C_4 羥烷基、 C_2 - C_4 烷羰基、 C_2 - C_6 烷氧羰基、 C_2 - C_6 烷羰基氧基、 C_2 - C_6 烷羰基硫基、 C_2 - C_6 烷胺基羰基、 C_3 - C_8 二烷胺基羰基或 C_3 - C_6 三烷基矽烷基；

R^{12} 為 C_1 - C_3 烷基；

各 Z^1 與 Z^2 為直接鍵結；

各 Z^4 係獨立為 $C(=O)$ 或 $S(O)_2$ ；

n 為 0、1 或 2；

k 為 0、1 或 2；

p 為 0、1 或 2；且

x 為 0 至 5 之整數；

其條件是，當 R^1 為未經取代之噻吩基，X 為 X^1 ，在式 1 中，
G 為未經取代之噻唑環，在其 2-位置處連接至 X，且在其 4-
位置處至 Z^1 ，且 J 為異噁唑環，在其 4-位置處連接至 Z^1 ，且
5 在其 5-位置處被甲基取代時，則 J 未在其 3-位置上被間位取
代之苯基取代。

本發明之具體實施例亦包括：

具體實施例 B1. 式 1A 化合物，其中各 R^{4a1} 與 R^{4a2} 係獨立為
C₁-C₃ 烷基、C₂-C₃ 烯基、C₂-C₃ 炔基、環丙基、C₁-C₃ 鹵烷
10 基、鹵環丙基、鹵素、氰基、硝基、C₁-C₂ 烷氧基或 C₁-C₂
鹵烷氧基。

具體實施例 B2. 具體實施例 B1 之化合物，其中各 R^{4a1} 與
 R^{4a2} 係獨立為 C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 鹵烷基、鹵素、氰基、
C₁-C₂ 烷氧基或 C₁-C₂ 鹵烷氧基。

15 具體實施例 B3. 具體實施例 B2 之化合物，其中各 R^{4a1} 與
 R^{4a2} 係獨立為 C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 鹵烷基或鹵素。

具體實施例 B4. 式 1A 化合物，其中 A^a 為 H。

具體實施例 B5. 式 1A 化合物，其中 A^a 為 CH₂CO₂H。

具體實施例 B6. 式 1A 化合物，其中 A^a 為 CH₂CO₂R³⁰。

20 具體實施例 B7. 式 1A 化合物，其中 A^a 為 CH₂C(=O)Cl。

具體實施例 B8. 式 1B 化合物，其中各 R^{4a1} 與 R^{4a2} 係獨立為
C₁-C₃ 烷基、C₂-C₃ 烯基、C₂-C₃ 炔基、環丙基、C₁-C₃ 鹵烷
基、鹵環丙基、鹵素、氰基、硝基、C₁-C₂ 烷氧基或 C₁-C₂
鹵烷氧基。

具體實施例B9. 具體實施例B8之化合物，其中各 R^{4a1} 與 R^{4a2} 係獨立為 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基。

具體實施例B10. 具體實施例B9之化合物，其中各 R^{4a1} 與 R^{4a2} 係獨立為 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基或鹵素。

具體實施例B11. 式1B化合物，其中 Z^3 為CN。

具體實施例B12. 式1B化合物，其中 Z^3 為 $C(=S)NH_2$ 。

關於本發明之式1C化合物，應注意的是，J-29之不同具體實施例可以兩種或多種對掌異構物形式存在。關於本發明式1C化合物之J-29具體實施例之對掌異構物形式係為關於在發明內容中所描述者。所有J-29對掌異構物係被包含在本發明中之式1C化合物內，關於其中沒有特定J-29對掌異構物形式被描述之具體實施例(例如J-29-33對掌異構物與J-29-22對掌異構物，以甲基位置為基礎)。

具體實施例B13. 式1C化合物，其中M為 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、羥基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_2 鹵烷氧基、 C_1 - C_3 烷胺基、 C_2 - C_6 二烷胺基、1-六氫吡啶基、1-四氫吡咯基或4-嗎福啉基。

特殊具體實施例包括式1化合物，選自包括：

4-[4-[(5R)-4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-[[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]六氫吡啶及其對掌異構物(化合物1)，

1-[[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]-4-[4-(5-苯基-3-異噁唑基)-2-噻唑基]六氫吡啶(化合物2)，

1-[4-[4-[(5R)-4,5-二氫-5-甲基-5-苯基-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮及其對掌異構物(化合物15)，

2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-[(3aS,9bR), 3a,4,5,9b-四氫萘[2,1-d]異噁唑-3-基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮及其對掌異構物(化合物16)，

1-[4-[4-[(5R)-4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-乙基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮及其對掌異構物(化合物19)，

2-[3,5-雙(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-[(5R)-4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮及其對掌異構物(化合物22)，

1-[4-[4-[(5R)-3',4'-二氫螺[異噁唑-5(4H),1',(2'H)-萘]-3-基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮及其對掌異構物(化合物37)，

1-[4-[4-[(5R)-2,3-二氫螺[1H-茛-1,5'(4'H)-異噁唑]-3'基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮及其對掌異構物(化合物44)，

2-[5-氯基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-[(5R)-4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮及其對掌異構物(化合物107)，

2-[(5R)-4,5-二氫-3-[2-[1-[2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]-4-六氫吡啶基]-4-噻唑基]-5-異噁唑基]-1H-異吲哚-1,3(2H)-二酮及其對掌異構物(化合物129)，

2-[5-氯基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-[(1R)-2,3-二氫螺[1H-茛-1,5'(4'H)-異噁唑]-3'基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮及其對掌異構物(化合物232)，

2-[5-氯基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-[(1'R)-3',4'-二氫螺[異噁唑-5(4H),1'(2'H)-蔡]-3-基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮及其對掌異構物(化合物230)，

2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-(3R)-螺[苯并呋喃-3(2H),5'(4'H)-異噁唑]-3'基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮及其對掌異構物(化合物185)，

1-[4-[4-[(1R)-2,3-二氫螺[1H-茛-1,5'(4'H)-異噁唑]-3'基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙酮及其對掌異構物(化合物165)，

2-[3,5-雙(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-[(1'R)-3',4'-二氫螺[異噁唑-5(4H),1'(2'H)-蔡]-3-基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮及其對掌異構物(化合物229)，

2-[3,5-雙(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-[(1R)-2,3-二氫螺[1H-茛-1,5'(4'H)-異噁唑]-3'基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮及其對掌異構物(化合物231)，

1-[4-[4-[(5R)-5-(2,6-二氯苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮及其對掌異構物(化合物135)，

1-[4-[4-[(5R)-4,5-二氫-5-(2-氟苯基)-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮及其對掌異構物(化合物79)，

1-[4-[4-[(5R)-4,5-二氫-5-(2-甲基苯基)-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮及其對掌異構物(化合物161) ,

1-[4-[4-[(5R)-5-(2,6-二甲基苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮及其對掌異構物(化合物178) ,

1-[4-[4-[(5R)-4,5-二氫-5-(2,4,6-三甲基苯基)-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮及其對掌異構物(化合物179) ,

1-[4-[4-[(1'R)-3',4'-二氫螺[異噁唑-5(4H),1'(2'H)-萘]-3-基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-(3,5-二甲基-1H-吡唑-1-基)乙酮及其對掌異構物(化合物164) ,

1-[4-[4-[(5R)-4,5-二氫-5-(2,4,6-三甲氧基苯基)-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮及其對掌異構物(化合物155) ,

3-[(5R)-4,5-二氫-3-[2-[1-[2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]-4-六氫吡啶基]-4-噻唑基]-5-異噁唑基]-2(3H)-苯并噁唑酮及其對掌異構物(化合物225) ,

1-[4-[4-[(5R)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮及其對掌異構物(化合物214) ,

2-[(5R)-4,5-二氫-3-[2-[1-[2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]-4-六氫吡啶基]-4-噻唑基]-5-異噁唑基]苯甲腈及其對掌異構物(化合物220) ,

2-[5-氯基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-[(5R)-4,5-二氫-5-甲基-5-苯基-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮及其對掌異構物(化合物 261) ,

2-[3,5-雙(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-[(5R)-4,5-二氫-5-甲基-5-苯基-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮及其對掌異構物(化合物 260) ,

1-[4-[4-[(5R)-5-(2-氯苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮及其對掌異構物(化合物 8) ,

1-[4-[4-[(5R)-4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[3-甲基-5-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮及其對掌異構物(化合物 128) ,

1-[4-[4-[(4S)-2,3-二氫螺[4H-1-苯并呋喃-4,5'(4'H)-異噁唑]-3'基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮及其對掌異構物(化合物 137) , 及

(5R)-4,5-二氫-3-[2-[1-[2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]-4-六氫吡啶基]-4-噻唑基]-5-苯基-5-異噁唑甲腈及其對掌異構物(化合物 265)。

特殊具體實施例亦包括式 1B 化合物，選自包括：

1-[2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]-4-六氫吡啶碳硫醯胺，

1-[2-[3,5-雙(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]-4-六氫吡啶碳硫醯胺，

1-[2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]-4-六氫吡

啖甲腓，及

1-[2-[3,5-雙(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙醯基]-4-六氫吡啶
甲腓。

值得注意的是，式1化合物，其包括其所有幾何與立體
5 異構物、N-氧化物及農業上適當鹽，含有彼等之農業組合
物，及其作為殺真菌劑之用途，其中

R^1 為視情況經取代之苯基或5-或6-員雜芳族環；

A 為 CH_2 或 NH ；

X 為 $X^1, X^2, X^3, X^4, X^5, X^6, X^7$ 或 X^8 ；

10 各 R^2 係獨立為 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烯基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4
烷氧基、鹵素、氰基或羥基；或

兩個 R^2 係一起採用為 C_1 - C_3 次烷基或 C_2 - C_3 次烯基，以形成
經橋接之雙環狀環系統；或

15 連接至藉由雙鍵接合之鄰近環碳原子之兩個 R^2 係一起採
用為 $-CH=CH-CH=CH-$ ，視情況被1至3個取代基取代，取
代基選自 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4
鹵烷氧基、鹵素、羥基、胺基、氰基及硝基；

20 J 為5-或6-員環或8-至11-員雙環狀環系統，各環或環系統含
有環員，選自碳及視情況選用之1至3個雜原子，選自
至高1個O，至高1個S，及至高3個N，且視情況包含
1至3個環員，選自包括 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 $S(O)$ 或 $S(O)_2$ ，各
環或環系統視情況被1至5個獨立選自 R^5 之取代基取
代；

各 R^5 係獨立為 H、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6

環烷基、C₄-C₁₀環烷基烷基、C₄-C₁₀烷基環烷基、C₅-C₁₀烷基環烷基烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₂-C₆鹵烯基、C₂-C₆鹵炔基、C₃-C₆鹵環烷基、鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、C₁-C₆烷氧基、C₁-C₆鹵烷氧基、C₁-C₆烷硫基、C₁-C₆烷基亞磺醯基、C₁-C₆烷基磺醯基、C₁-C₆鹵烷硫基、C₁-C₆鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₆鹵烷基磺醯基、C₁-C₆烷胺基、C₂-C₈二烷胺基、C₃-C₆環烷胺基、C₂-C₆烷氧烷基、C₂-C₆鹵烷氧基烷基、C₁-C₆羥烷基、C₂-C₆烷羰基、C₂-C₆烷氧羰基、C₂-C₆烷羰基氧基、C₂-C₆烷胺基羰基、C₃-C₈二烷胺基羰基、C₃-C₆三烷基矽烷基或-Z²Q；

各Q係獨立為視情況經取代之苯基、苣基、萘基、C₃-C₆環烷基、C₃-C₆環烯基或5-或6-員雜芳族環，各視情況被1至3個取代基取代，取代基選自在碳環員上之R⁷與在氮環員上之R¹²；

各R⁷係獨立為C₁-C₆烷基、C₂-C₆烯基、C₂-C₆炔基、C₃-C₆環烷基、C₄-C₁₀環烷基烷基、C₄-C₁₀烷基環烷基、C₅-C₁₀烷基環烷基烷基、C₁-C₆鹵烷基、C₂-C₆鹵烯基、C₂-C₆鹵炔基、C₃-C₆鹵環烷基、鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵烷氧基、C₁-C₄烷硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基、C₁-C₄鹵烷硫基、C₁-C₄鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₄鹵烷基磺醯基、C₁-C₄烷胺基、C₂-C₈二烷胺基、C₃-C₆環烷胺基、C₂-C₄烷氧烷基、C₁-C₄羥烷基、C₂-C₄烷羰基、C₂-C₆烷氧羰基、C₂-C₆

烷羰基氧基、 C_2 - C_6 烷羰基硫基、 C_2 - C_6 烷胺基羰基、 C_3 - C_8 二烷胺基羰基或 C_3 - C_6 三烷基矽烷基；或

R^5 與 R^7 係和連結 R^5 與 R^7 之原子一起採用，以形成視情況經取代之5-至7-員環，含有作為環員之2至7個碳原子，
5 及視情況選用之1至3個雜原子，選自至高1個O，至高1個S，及至高1個N；

各 Z^1 與 Z^2 係獨立為直接鍵結、O、 $S(O)_m$ 、 CHR^{20} 或 NR^{21} ；

R^{21} 為H或 C_1 - C_3 烷基；且

m 為0、1或2(應明瞭的是其係意謂各 m 係獨立為0、1或2)。

10 本發明係提供殺真菌組合物，其包含式1化合物(包括其所有幾何與立體異構物、N-氧化物及鹽)與至少一種其他殺真菌劑。值得注意的是，作為此種組合物之具體實施例者為包含相應於任何上述化合物具體實施例之化合物之組合物。

15 本發明係提供殺真菌組合物，其包含殺真菌上有效量之式1化合物(包括其所有幾何與立體異構物、N-氧化物及農業上適當鹽)與至少一種其他成份，選自包括界面活性劑、固體稀釋劑及液體稀釋劑。值得注意的是，作為此種組合物之具體實施例者為包含相應於任何上述化合物具體實施
20 例之化合物之組合物。

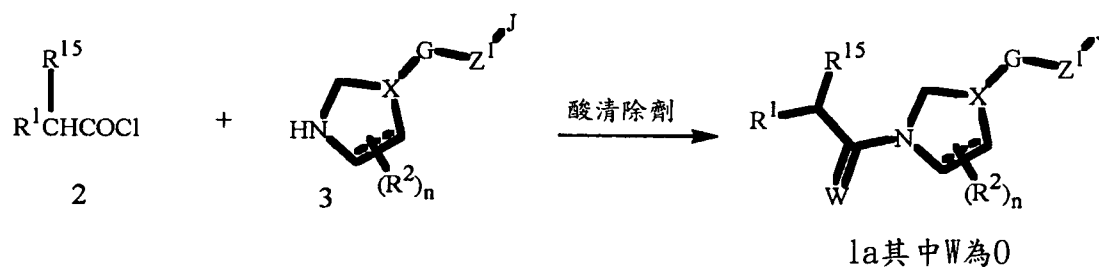
本發明係提供一種控制因真菌植物病原所造成之植物疾病之方法，其包括對植物或其部份或對植物種子施用殺真菌上有效量之式1化合物(包括其所有幾何與立體異構物、N-氧化物及農業上適當鹽)。值得注意的是，作為此種方法

之具體實施例者為包括施用殺真菌上有效量之相應於任何上述化合物具體實施例之化合物之方法。特別值得注意的是，其中化合物係以本發明組合物施用之具體實施例。

式1、1A、1B及1C化合物可藉一或多種如圖式1-20中所述之下述方法與變異方式製成。在下文式1-38化合物中之A, G, J, W, X, Q, Z¹, R¹, R², R¹⁵, R¹⁶及n之定義，均如上文在發明內容中之定義，除非另有指明。式1a-1e及式1Ba與1Bb係個別為式1與1B之不同子集。

如圖式1中所示，式1a化合物(式1，其中A為CHR¹⁵)，其中W為O，可經由使式2氯化醯與式3胺，於酸清除劑存在下偶合而製成。典型酸清除劑包括胺鹼，譬如三乙胺、N,N-二異丙基乙胺及吡啶。其他清除劑包括氫氧化物，譬如氫氧化鈉與鉀，與碳酸鹽，譬如碳酸鈉與碳酸鉀。在某些情況中，可使用聚合體所承載之酸清除劑，譬如聚合體結合之N,N-二異丙基乙胺與聚合體結合之4-(二甲胺基)吡啶。式3胺類之酸鹽亦可使用於此反應中，其條件是有至少2當量之酸清除劑存在。用以形成與胺類之鹽之典型酸類，包括鹽酸、草酸及三氟醋酸。在後續步驟中，式1a醯胺類，其中W為O，可被轉化成式1a硫醯胺，其中W為S，使用多種標準硫化試劑，譬如五硫化磷或2,4-雙(4-甲氧苯基)-1,3-二硫-2,4-二磷四環-2,4-二硫化物(Lawesson氏試劑)。

圖式 1

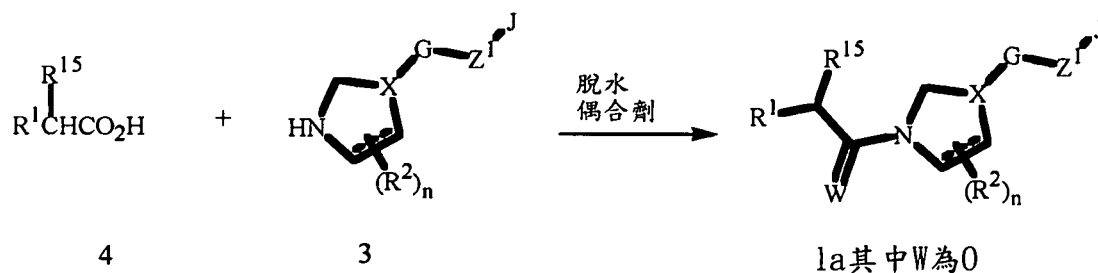


關於製備其中 W 為 O 之式 1a 化合物之替代程序，係描繪於圖式 2 中，且係涉及式 4 酸與式 3 胺(或其酸鹽)，於脫水偶合試劑存在下之偶合，譬如二環己基碳化二亞胺 (DCC)、1-(3-二甲胺基丙基)-3-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽 (EDC) 或六氟磷酸 O-苯并三唑-1-基-N,N,N',N'-四甲基 (HBTU)。可再一次於此處使用聚合體所承載之試劑，譬如聚合體結合之環己基碳化二亞胺。此等反應典型上係在 0-40°C 下，於溶劑中，譬如二氯甲烷或乙腈，於鹼譬如三乙胺或 N,N-二異丙基乙胺存在下進行。式 4 酸類係為已知，或可藉熟諳此藝者已知之方法製備。例如， R^1CH_2COOH ，其中 R^1 為經過氮連結之雜芳族環，可經由使其相應之 R^1H 化合物與鹵基醋酸或酯，於鹼存在下反應而製成；參閱，例如美國專利 4,084,955。

R^1CH_2COOH ，其中 R^1 為苯基或經過碳連結之雜芳族環，可製自其相應之 R^1CH_2 -鹵素化合物，其方式是鹵素以氰化物之置換，接著為水解作用；參閱，例如 K. Adachi, Yuki Gosei Kagaku Kyokaishi 1969, 27, 875-876；自 $R^1C(=O)CH_3$ ，藉由 Willgerodt-Kindler 反應；參閱，例如 H. R. Darabi 等人, Tetrahedron Letters 1999, 40, 7549-7552，及 M. M. Alam 與 S. R. Adapa, 合成通信期刊 (Synthetic Communications) 2003, 33, 59-63，及其中引述之

參考資料；或自 R^1Br 或 R^1I ，藉由與醋酸第三-丁酯或丙二酸二乙酯之鈀催化偶合，接著為酯水解作用；參閱，例如 W. A. Moradi 與 S. L. Buchwald, J. Am. Chem. Soc. 2001, 123, 7996-8002，與 J. F. Hartwig 等人, J. Am. Chem. Soc. 2002, 124, 12557-12565。

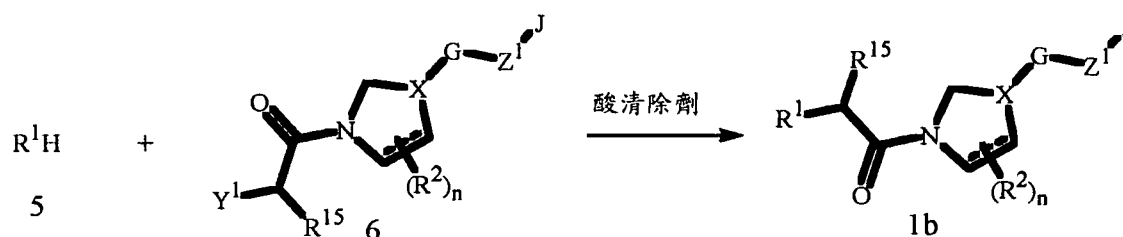
圖式 2



因合成文獻包括許多醯胺形成方法，故圖式 1 與 2 之合成程序僅只是可用於製備式 1 化合物之極多種方法之代表性實例。熟諳此藝者亦明白的是，式 2 氯化醯可藉由許多習知方法製自式 4 酸類。

某些式 1b 化合物(式 1，其中 A 為 CHR^{15} ，且 W 為 O)，其中 R^1 為經過氮原子連結之 5-員含氮雜芳族環，可經由式 5 母體雜環與式 6 鹵基乙醯胺之反應而製成，如圖式 3 中所示。反應係於鹼存在下，譬如氫化鈉或碳酸鉀，在溶劑中，譬如四氫呋喃、N,N-二甲基甲醯胺或乙腈，於 0 至 80°C 下進行。式 6 鹵基乙醯胺可類似圖式 1 與 2 中所述之醯胺形成反應，經由使式 3 胺個別與 α -鹵酸鹵化物或 α -鹵酸或其酐反應而製成。

圖式 3



其中 R^1 為 5-員含氮雜芳族環，於 N 上未經取代；且 Y^1 為 Cl、Br 或 I。

5 式 1c 化合物 (式 1，其中 A 為 NH)，其中 R^1 為苯基、萘基或 5-或 6-員雜芳族環，且 W 為 O 或 S，可經由使式 3 胺個別與式 7 之異氰酸酯或異硫氰酸酯反應而製成，如圖式 4 中所描繪。此反應典型上係於環境溫度下，在非質子性溶劑譬如二氯甲烷或乙腈中進行。

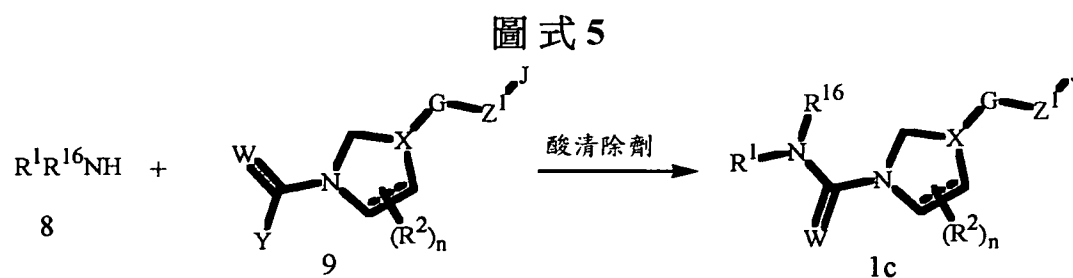
圖式 4



1c 其中 W 為 O 或 S, 且 R^{16} 為 H

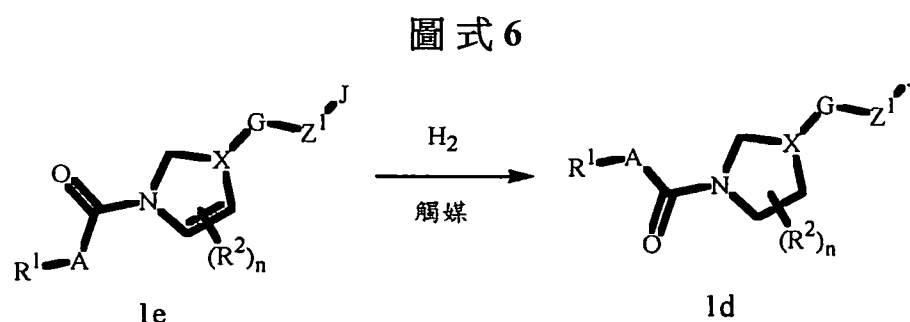
式 1c 化合物亦可經由使式 8 胺與式 9 之胺甲醯基或胺硫甲醯基氯化物或咪唑反應而製成，如圖式 5 中所示。當 Y 為氯時，反應典型上係於酸清除劑存在下進行。典型酸清除劑包括胺鹼，譬如三乙胺、N,N-二異丙基乙胺及吡啶。其他清除劑包括氫氧化物，譬如氫氧化鈉與鉀，與碳酸鹽，譬如碳酸鈉與碳酸鉀。式 9 之胺甲醯基或胺硫甲醯基氯化物 (其中 Y 為 Cl) 可根據熟諳此藝者所已知之一般方法，個別經由以光氣或硫代光氣或其相當物處理，製自式 3 胺類，而式

9 之胺甲醯基或胺硫甲醯基咪唑 (其中 Y 為咪唑 -1-基) 可個別經由以 1,1'-羰基二咪唑或 1,1'-硫代羰基二咪唑處理，製自式 3 胺類。



其中 W 為 O 或 S；且 Y 為 Cl 或咪唑 -1-基。

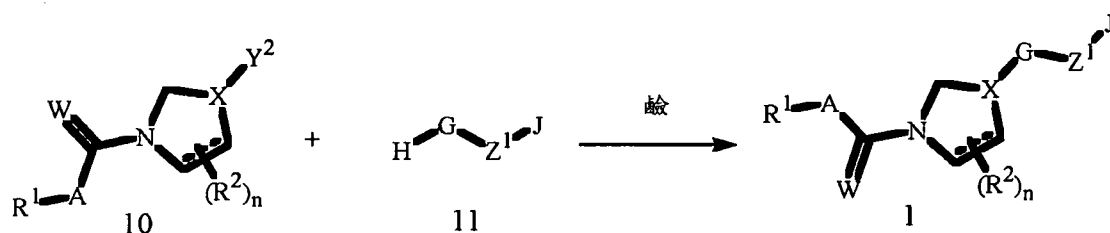
某些式 1d 化合物 (意即式 1，其中含有 X 之環為飽和) 可如圖式 6 中所示，藉催化性氫化，製自式 1e 化合物，其中含有 X 之環為不飽和。典型條件係涉及將式 1e 化合物曝露至氫氣，在 70 至 700 kPa，較佳為 270 至 350 kPa 之壓力下，於金屬觸媒存在下，譬如被承載於惰性載體譬如活性碳上之鈀，其重量比為 5 至 20% 之金屬對載體，經懸浮於溶劑中，譬如乙醇，在環境溫度下。此類型之還原作用係極為習知；參閱，例如催化氫化作用，L. Cerveny 編著，Elsevier Science, Amsterdam, 1986。熟諳此藝者將明瞭的是，可存在於式 1e 化合物中之其他某些官能基亦可在催化氫化條件下被還原，因此需要觸媒與條件之適當選擇。



其中 X 為 X¹, X², X⁵, X⁸ 或 X⁹。

某些式1化合物，其中X為 X^1 , X^5 , X^7 或 X^9 ，且G係經由氮原子連結至含有X之環，可藉由適當脫離基 Y^2 ，在式10之含X環上，以式11之含氮雜環，於鹼存在下置換而製成，如圖式7中所描繪。適當鹼包括氫化鈉或碳酸鉀，且反應係在溶劑中，譬如N,N-二甲基甲醯胺或乙腈，於0至80°C下進行。在式10化合物中之適當脫離基包括溴化物、碘化物、甲磺酸鹽($OS(O)_2CH_3$)、三氟甲磺酸鹽($OS(O)_2CF_3$)等，且式10化合物可使用此項技藝中已知之一般方法製自其相應之化合物，其中 Y^2 為OH。

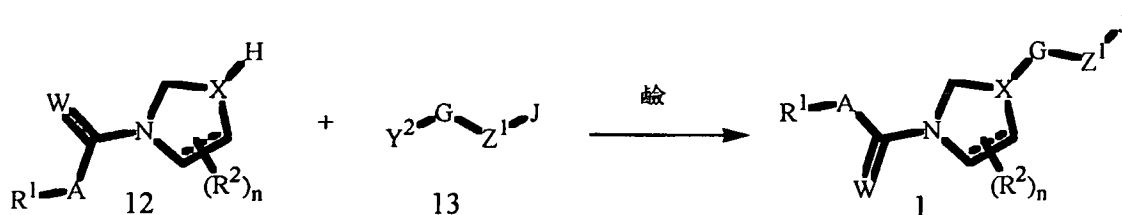
圖式7



其中W為O或S；X為 X^1 , X^5 , X^7 或 X^9 ；且 Y^2 為脫離基，譬如Br、I、 $OS(O)_2Me$ 或 $OS(O)_2CF_3$ 。

式1化合物，其中X為 X^2 或 X^8 ，可經由式12化合物與式13之雜環族鹵化物或三氟甲磺酸鹽($OS(O)_2CF_3$)之反應而製成，如圖式8中所示。反應係於鹼存在下，譬如碳酸鉀，在溶劑中，譬如二甲亞砜、N,N-二甲基甲醯胺或乙腈，於0至80°C下進行。式13化合物，其中 Y^2 為三氟甲磺酸鹽，可藉熟諳此藝者已知之方法製自其相應之化合物，其中 Y^2 為OH。

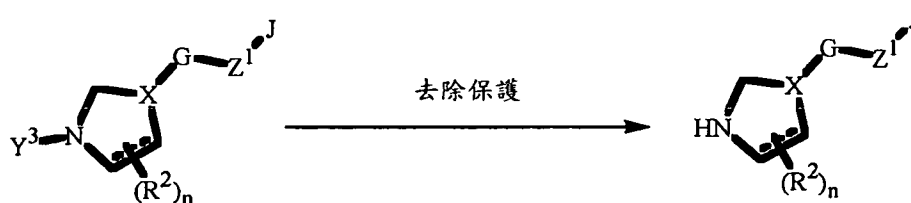
圖式 8



其中 W 為 O 或 S；X 為 X² 或 X⁸；且 Y² 為脫離基，譬如 Br、I、OS(O)₂Me 或 OS(O)₂CF₃。

式 3 胺化合物可製自式 14 之經保護胺化合物，其中 Y³ 為胺保護基，如圖式 9 中所示。極多陣列之胺保護基係可取用 (參閱，例如 T. W. Greene 與 P. G. M. Wuts, 有機合成之保護基, 第 2 版；Wiley：New York, 1991)，且適當保護基之使用與選擇係為熟諳化學合成者所明瞭。保護基可被移除，且胺係被單離成其酸鹽或自由態胺，藉由此項技藝中已知之一般方法。熟諳此藝者亦將明瞭的是，式 14 之經保護胺類可藉由類似上文圖式 6、7 及 8 中所述之方法製成，其中基團 R¹AC(=W) 係被 Y³ 置換，而得可使用之式 14 中間物，以製備式 1 化合物。

圖式 9



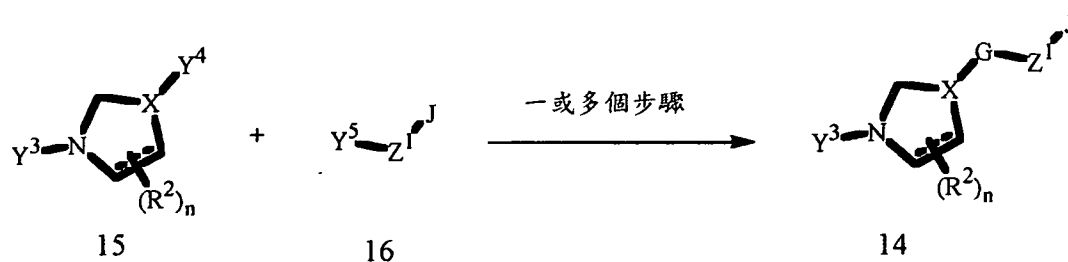
14 其中 Y³ 為胺保護基

3

式 14 化合物亦可經由適當官能基化之式 15 化合物與適當官能基化之式 16 化合物之反應而製成，如圖式 10 中所示。官能基 Y⁴ 與 Y⁵ 係選自但不限於以下部份基團，譬如醛類、

酮類、酯類、酸類、醯胺類、硫醯胺類、腈類、胺類、醇
 類、硫醇類、肼類、肟類、脒類、醯胺肟類、烯烴類、乙
 炔類、鹵化物、烷基鹵化物、甲烷磺酸鹽、三氟甲烷磺酸
 鹽、二羥基硼烷、二羥基硼烷化物等，其在適當反應條件
 5 下，將允許建立各種雜環 G。以下述作為實例，式 15 化
 合物，其中 Y⁴ 為硫醯胺基團，與式 16 化合物之反應，其中 Y⁵
 為溴基乙醯基，係獲得式 14 化合物，其中 G 為噻唑環。合
 成文獻係描述許多關於形成 5-員雜芳族環與 5-員部份飽和
 雜環(例如 G-1 至 G-59)之一般方法；參閱，例如綜合雜環化
 10 學，第 4-6 卷，A. R. Katritzky 與 C. W. Rees 編輯者，Pergamon 出版
 社，New York, 1984；綜合雜環化學 II，第 2-4 卷，A. R. Katritzky, C.
 W. Rees 與 E. F. Scriven 編輯者，Pergamon 出版社，New York, 1996；
 及雜環族化合物化學系列，E. C. Taylor 編輯者，Wiley, New
 York。利用式 15 中間物，其中 X 為 X¹，且 Y⁴ 為 Br、I、甲烷
 15 磺酸鹽或三氟甲烷磺酸鹽，以製備有機鋅試劑，供使用於
 與芳族環之交叉偶合反應已被描述；參閱，例如 S. Bellotte,
 Synlett 1998, 379-380 與 M. Nakamura 等人，Synlett 2005, 1794-1798。
 熟諳此藝者明瞭如何選擇適當官能基，以建構所要之雜
 環，譬如 G。式 15 與 16 化合物係為已知，或可由熟諳此藝
 20 者製成。

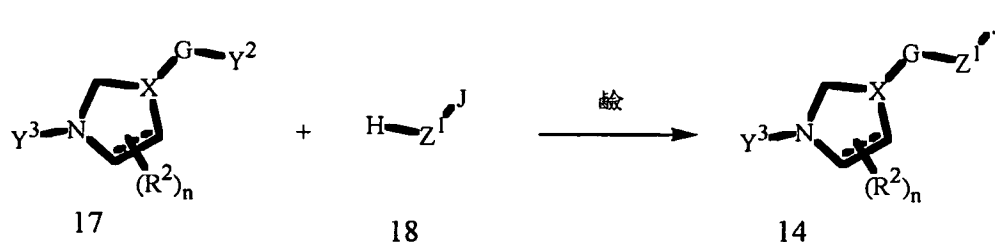
圖式 10



其中 Y⁴ 與 Y⁵ 為適合用以建構所要雜環 G 之官能基。

某些式 14 化合物，其中 Z¹ 為 O、S 或 NR²¹，可藉由適當脫離基 Y²，在式 17 之 G 上，以式 18 化合物，於鹼存在下置換而製成，如圖式 11 中所描繪。適當鹼包括氫化鈉或碳酸鉀，且反應係在溶劑中，譬如 N,N-二甲基甲醯胺或乙腈，於 0 至 80°C 下進行。在式 17 化合物中之適當脫離基包括溴化物、碘化物、甲烷磺酸鹽 (OS(O)₂CH₃)、三氟甲烷磺酸鹽 (OS(O)₂CF₃) 等。式 17 化合物可藉由此項技藝中已知之一般方法製自其相應之化合物，其中 Y² 為 OH。許多式 18 化合物係為已知，或可藉由此項技藝中已知之一般方法製成。

圖式 11

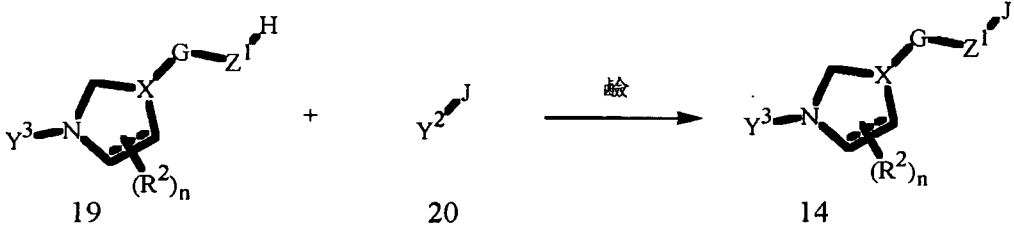


其中 Y² 為脫離基，譬如 Br、I、OS(O)₂Me 或 OS(O)₂CF₃；且 Z¹ 為 O、S 或 NR²¹。

某些式 14 化合物，其中 Z¹ 為 O、S 或 NR²¹，亦可藉由適當脫離基 Y²，在式 20 之 J 上，以式 19 化合物，於鹼存在下置換而製成，如圖式 12 中所描繪。適當鹼包括氫化鈉或碳酸鉀，

5

圖式 12

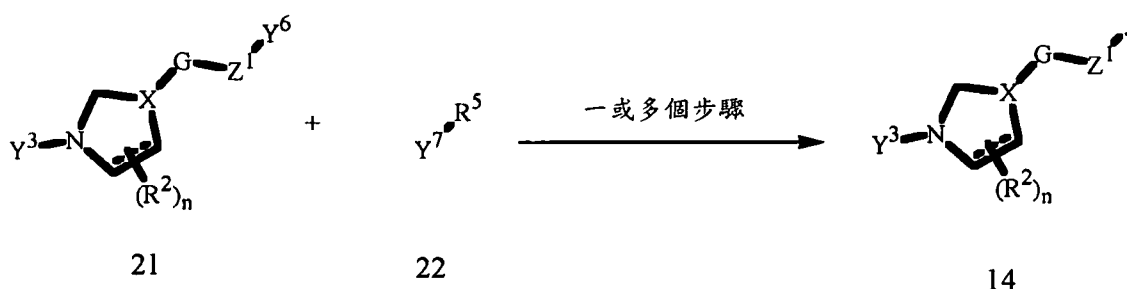


其中 Y^2 為脫離基，譬如 Br 、 I 、 $OS(O)_2Me$ 或 $OS(O)_2CF_3$ ；且 Z^1 為 O 、 S 或 NR^{21} 。

20

Pergamon 出版社, New York, 1984; 綜合雜環化學 II, 第 2-4 卷, A. R. Katritzky, C. W. Rees 及 E. F. Scriven 編輯者, Pergamon 出版社, New York, 1996; 雜環族化合物化學系列, E. C. Taylor 編輯者, Wiley, New York, 及 Rodd 氏碳化合物化學, 第 2-4 卷, Elsevier, New York。關於腈氧化物以烯烴之環加成作用之一般程序, 係充分記載於化學文獻上。有關聯之參考資料, 可參閱 Lee, Synthesis, 1982, 6, 508-509, 與 Kanemasa 等人, Tetrahedron 2000, 56, 1057-1064, 以及其中所引用之參考資料。熟諳此藝者明瞭如何選擇適當官能基, 以建構所要之雜環 J。式 22 化合物係為已知, 或可藉由此項技藝中已知之一般方法製成。

圖式 13



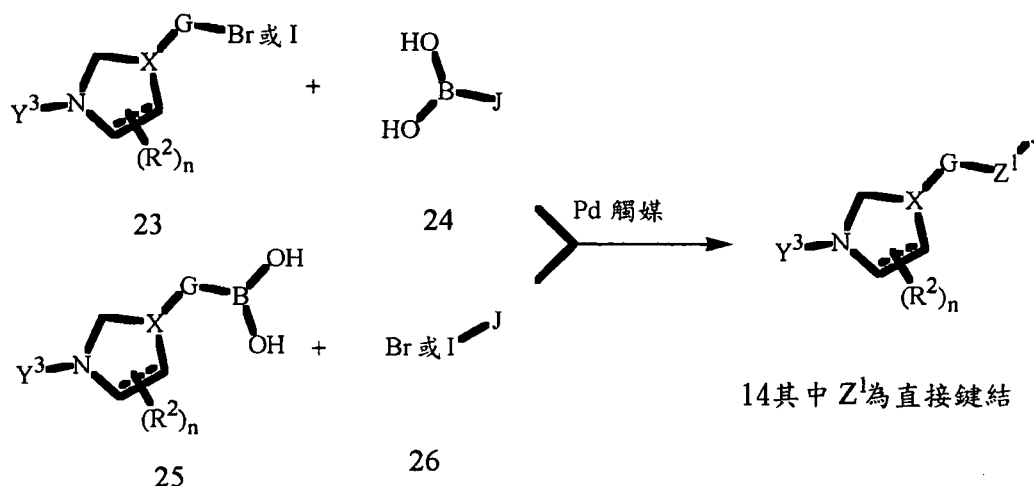
其中 Y⁶ 與 Y⁷ 為適合用以建構所要雜環 J 之官能基。

關於式 14 化合物之替代製備, 其中 Z¹ 為一個鍵結, 係包括習知 Suzuki 反應, 涉及式 23 或 26 之碘化物或溴化物, 個別與式 24 或 25 之二羟基硼烷之 Pd-催化交叉偶合, 如圖式 14 中所示。許多觸媒可用於此類型之轉變; 典型觸媒為肆(三苯膦)鈀。溶劑, 譬如四氫呋喃、乙腈、乙醚及二氧陸圓係為適當。Suzuki 反應與相關偶合程序係提供許多產生 G-J 鍵結之替代方式。關於主要參考資料, 參閱, 例如 C. A. Zifcsak 與 D. J. Hlasta, Tetrahedron 2004, 60, 8991-9016。關於可適用於合

成 G-J 鍵結之鈀化學之充分回顧，可參閱 J. J. Li 與 G. W. Gribble 編輯者，雜環化學上之鈀：合成化學師指引, Elsevier: Oxford, UK, 2000。觸媒類型、鹼及反應條件之許多變型，關於此一般方法，係為此項技藝中已知。

5

圖式 14



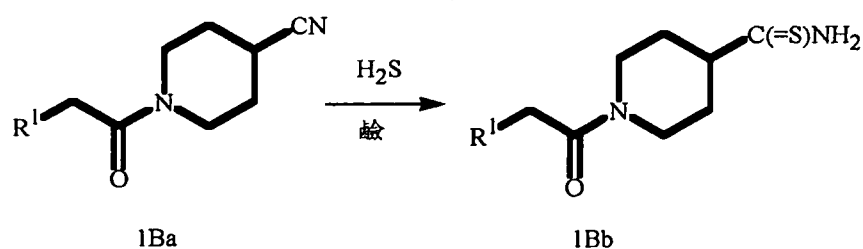
熟諳此藝者將明瞭的是，許多式 1 化合物可直接藉由類似上文圖式 10 至 14 中所述之方法製成，其中基團 Y³係被 R¹AC(=W)置換。因此，相應於式 15、17、19、21、23 及 25 之化合物，其中 Y³係被 R¹AC(=W)置換，係為關於製備式 1 化合物之有用中間物。

10

式 1Bb 硫醯胺為特別有用之中間物，以製備式 1 化合物，其中 X 為 X¹。式 1Bb 硫醯胺可藉由硫化氫添加至其相應之式 1Ba 腈中而製成，如圖式 15 中所示。

15

圖式 15

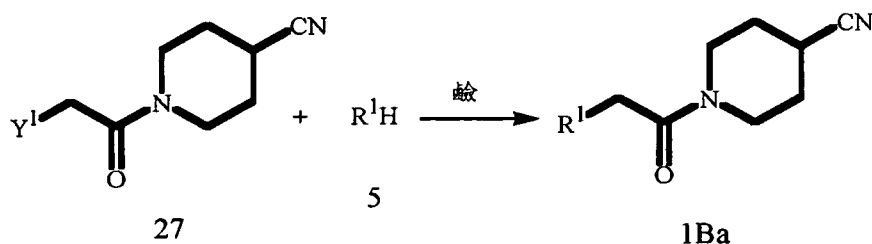


其中 R¹係如關於式 1 所定義。

圖式 15 之方法可經由使式 1Ba 化合物與硫化氫，於胺譬如吡啶、二乙胺或二乙醇胺存在下接觸而進行。或者，硫化氫可以其與鹼金屬或氨之二硫化物鹽之形式使用。此類型之反應係於文獻(例如 A. Jackson 等人, EP 696,581 (1996))上充分記載。

某些式 1Ba 化合物，其中 R^1 為經過氮原子連結之 5-員含氮雜芳族環，可經由式 5 母體雜環與式 27 鹵基乙醯胺之反應而製成，如圖式 16 中所示。反應係於鹼存在下，譬如氫化鈉或碳酸鉀，在溶劑中，譬如四氫呋喃、N,N-二甲基甲醯胺或乙腈，於 0 至 80°C 下進行。

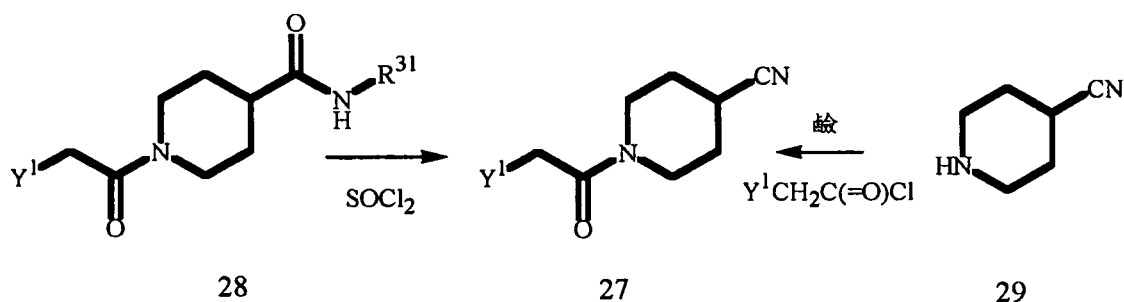
圖式 16



其中 R^1 為 5-員含氮雜芳族環，在 N 上未經取代(意即包含式 -(NH)- 環員之 5-員雜芳族環)；且 Y^1 為 Cl、Br 或 I。

式 27 鹵基乙醯胺可藉由圖式 17 中所示之兩種方法製成。

圖式 17



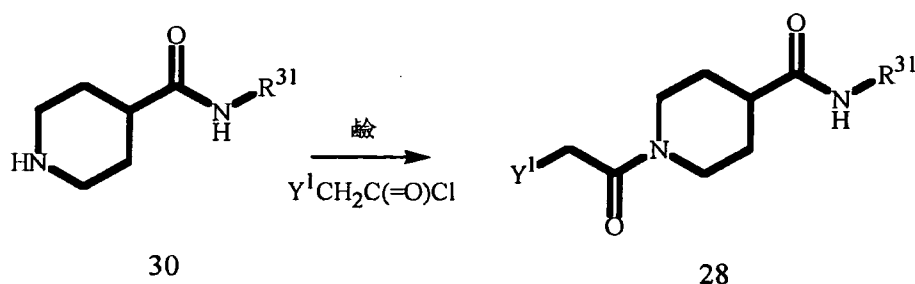
其中 Y^1 為 Cl、Br 或 I；且 R^{31} 為三級烷基，譬如 -C(Me)₃。

於一種方法中，式 29 之 4-氰基六氫吡啶係根據標準方

法，經由與適當氯化鹵乙醯，典型上於鹼存在下接觸，而被鹵乙醯基化。較佳條件係涉及使用無機鹼之水溶液，該鹼譬如鹼金屬或鹼土金屬碳酸鹽、重碳酸鹽或磷酸鹽，與水不可溶混之有機溶劑，譬如甲苯、醋酸乙酯或1,2-二氯乙烷。於圖式17中所描述之第二種方法中，式28之1-(鹵乙醯基)-N-取代之六氫異菸鹼醯胺衍生物，其中 R^{31} 為三級烷基，譬如 $C(Me)_3$ ，係使用標準醯胺脫水劑，譬如二氯化亞硫醯或氯化磷醯，在適當溶劑中脫水。關於此轉變之特佳溶劑為N,N-二烷基醯胺，譬如N,N-二甲基甲醯胺。反應典型上係以下述方式進行，將0.9至2當量，較佳為1.1當量之氯化磷醯或二氯化亞硫醯，添加至式28化合物與0.5至10重量份數之溶劑之混合物中，在反應係於添加期間快速地進行之溫度下。此反應之添加時間典型上為約20至90分鐘，在約35至55°C之典型溫度下。

如圖式18中所示，式28化合物可藉由類似關於圖式17所述之鹵乙醯基化反應，製自式30化合物。

圖式18



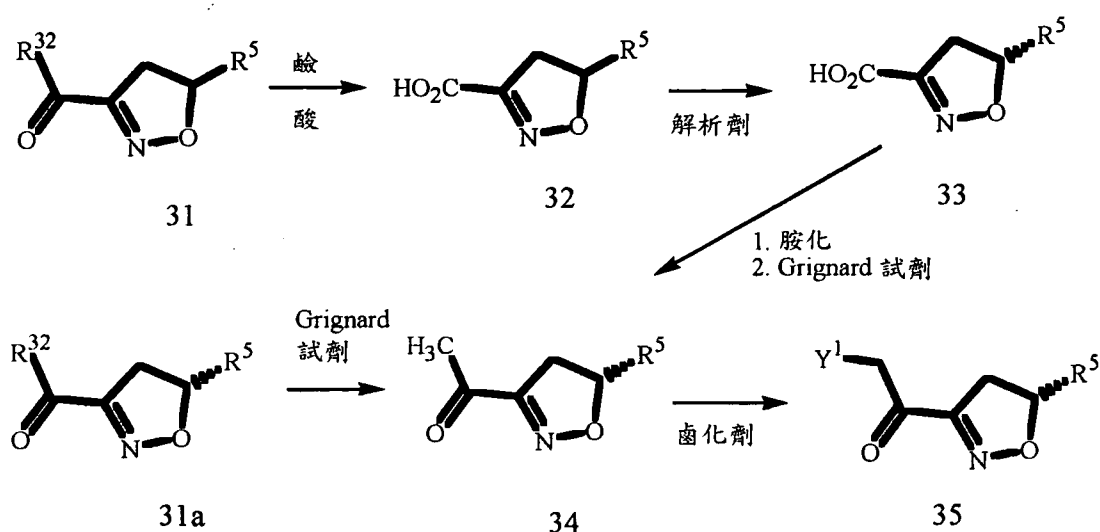
式30化合物係為已知，或可使用此項技藝中所習知之方法，製自4-氰基吡啶或異菸鹼酸；參閱，例如G. Marzolph等人，DE 3,537,762 (1986)，關於N-第三-丁基吡啶羧醯胺自氰基

吡啶與第三-丁醇之製備，與 S. F. Nelsen 等人，J. Org. Chem., 1990, 55, 3825，關於 N-甲基異菸鹼鹽胺以鉑觸媒之氫化作用。

式 35 鹵甲基異噁唑酮類為關於製備某些對掌性式 1 化合物之特別有用之中間物，其中 J 係例如選自 J-29-1 至 J-29-12。

式 35 鹵甲基異噁唑酮類可藉由圖式 19 中所示之多步驟反應順序製成。

圖式 19



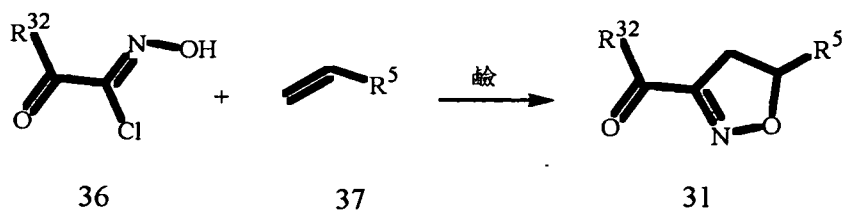
其中 R^{32} 為 C_2-C_8 二烷基胺基、 C_2-C_6 鹵烷基胺基、1-六氫吡啶基、1-四氫吡咯基或 4-嗎福啉基；且 R^5 係如上文發明內容中之定義。

式 32 外消旋羧酸類之製備可根據其相應式 31 化合物之鹼性或酸性水解之習知方法，較佳係使用稍微過量之氫氧化鈉，在水可溶混共溶劑中，譬如甲醇或四氫呋喃，於約 25 至 45°C 下達成。產物可藉由調整 pH 至約 1 至 3，然後過濾或萃取，視情況在藉由蒸發移除有機溶劑之後被單離。式 32 外消旋羧酸類可藉由適當對掌性胺鹼之非對映異構鹽之標準分級結晶解析，該胺鹼譬如金雞寧、二氫金雞寧或其混

合物。在約 85:15 比例下之金雞寧-二氫金雞寧混合物係為特別有用，因其提供例如式 33 之 (R)-配置之羧酸類，其中 R⁵ 為經取代之苯基，作為較不可溶鹽。再者，此等對掌性胺鹼係為商業規模上易於取得。在與式 1Bb 硫醯胺偶合後，式 35 之 (R)-配置之鹵甲基酮中間物係提供式 1 之較具殺真菌活性最後產物。式 35 鹵甲基酮類可以下述方式製成，首先使相應之式 31 醯胺類，無論是作為純對掌異構物(意即式 31a)或以對掌異構上富含或外消旋混合物，與一莫耳當量之鹵化甲基鎂(Grignard 試劑)，在適當溶劑或溶劑混合物中，譬如四氫呋喃與甲苯，於約 0 至 20°C 下反應，且式 34 粗製酮產物可經由以含水酸使反應淬滅，萃取及濃縮而被單離。接著，式 34 粗製酮類係以試劑譬如二氯化硫醯鹵化，而得式 35 氯基甲基酮類，其中 Y¹ 為 Cl，或分子溴，而得相應之式 35 溴基甲基酮類，其中 Y¹ 為 Br。式 35 鹵甲基酮類可自溶劑譬如己烷或甲醇，藉結晶而純化，或可被使用於與硫醯胺之縮合反應中，無需進一步純化。

式 31 異噁唑羧醯胺可藉由相應之式 36 氯化異羧肟醯與式 37 烯烴衍生物之環加成作用而製成，如圖式 20 中所示。

圖式 20



於此方法中，係使全部三種反應成份(式 36 與 37 化合物及鹼)接觸，以使式 36 氯化異羧肟醯之水解作用或二聚合作用

降至最低。在一個典型程序中，係將鹼，其可無論是三級胺鹼譬如三乙胺，或無機鹼譬如鹼金屬或鹼土金屬碳酸鹽、重碳酸鹽或磷酸鹽，與式37烯烴衍生物混合，且慢慢添加式36氯化異羧酐，在環加成作用係於相對較快速率下進行之溫度下，典型上在5與25°C之間。或者，可將鹼逐漸添加至另兩種成份(式36與37化合物)中。當式36氯化異羧酐實質上不溶於反應媒質中時，此替代程序係為較佳。在反應媒質中之溶劑可為水或惰性有機溶劑，譬如甲苯、己烷，或甚至是該烯烴衍生物以過量使用。產物可藉過濾，或以水洗滌，接著蒸發溶劑，自鹽共同產物分離。粗產物可藉由結晶化作用純化，或粗產物可直接使用於圖式19之方法中。式31化合物對相應之式34甲基酮類與式35鹵甲基酮類為可使用之先質，且亦可用於製備式34與35化合物之經解析對掌異構物，藉由水解、解析、甲基酮合成及鹵化作用，如圖式19中所示。

應明瞭的是，上文關於製備式1、1A、1B及1C化合物所述之一些試劑與反應條件，可能不與存在於中間物中之某些官能基相容。在此等情況中，保護/去除保護順序或官能基相互轉化之併入合成中，將有助於獲得所要之產物。保護基之使用與選擇係為熟諳化學合成者所明瞭(參閱，例如T. W. Greene與P. G. M. Wuts, 有機合成之保護基，第2版；Wiley: New York, 1991)。熟諳此藝者將明瞭的是，在一些情況中，在引進如任何個別圖式中所描述之特定試劑後，可能必須進行其他並未詳細描述之例行合成步驟，以完成式

1、1A、1B及1C化合物之合成。熟諳此藝者亦將明瞭的是，可能必須進行上文圖式中所示步驟之組合，以一種順序，其並非由所提出以製備式1、1A、1B及1C化合物之特定順序所意謂者。

- 5 熟諳此藝者亦將明瞭的是，可使本文中所述之式1、1A、1B及1C化合物及中間物接受各種親電子性、親核性、自由基、有機金屬、氧化及還原反應，以加入取代基或修改現存之取代基。

【圖式簡單說明】

- 10 無

【實施方式】

- 咸信熟諳此藝者無需進一步精心推敲，使用前述說明可將本發明利用至其最完全程度。因此，下述實例係被解釋為僅只是說明例而已，並非以無論任何方式限制本揭示內容。於下述實例中之步驟係說明關於各步驟在整個合成轉變中之程序，且各步驟之起始物質可能未必已藉由特定預備操作製成，其程序係描述於其他實例或步驟中。百分比均為重量比，惟對層析溶劑混合物除外，或其中另有指出。關於層析溶劑混合物之份數與百分比係為體積比，除非另有指出。¹H NMR光譜係以距四甲基矽烷低磁場之ppm作報告；"s"意謂單重峰，"d"意謂二重峰，"t"意謂三重峰，"m"意謂多重峰，"q"意謂四重峰，"dd"意謂二重峰之二重峰，"br s"意謂寬廣單峰，"br d"意謂寬廣二重峰，"br t"意謂寬廣三重峰，"br m"意謂寬廣多重峰。

實例 1

4-[4-[4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-[[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]六氫吡啶(化合物1)之製備

步驟 A: 4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶羧酸 1,1-二甲基乙酯之製備

於 4-(4-甲醯基-2-噻唑基)-1-六氫吡啶羧酸 1,1-二甲基乙酯 (1.0 克, 3.4 毫莫耳) 在乙醇 (5 毫升) 中之懸浮液內, 添加羥胺水溶液 (50 重量%, 0.25 毫升, 4.0 毫莫耳)。將反應混合物在 60°C 下加熱 1 小時, 於此段時間內, 反應混合物變成均勻。使所形成之溶液冷卻至室溫, 並以四氫呋喃 (10 毫升) 稀釋。於反應混合物中, 添加苯乙烯 (0.57 毫升, 5 毫莫耳), 接著分次添加 Clorox® 次氯酸鈉水溶液 (10.5 毫升), 歷經 3 小時。將反應混合物在室溫下攪拌過夜, 並過濾所形成之固體, 以水與乙醚洗滌, 且風乾, 而得標題化合物, 為白色粉末 (610 毫克)。將濾液以飽和碳酸氫鈉水溶液稀釋, 並以乙醚萃取。使萃液脫水乾燥 (MgSO₄), 及在減壓下濃縮, 而得 850 毫克標題化合物, 為黃色油。將此油以乙醚 (4 毫升) 稀釋, 並使其靜置, 而得另外之 233 毫克產物, 為白色固體。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.47 (s, 9H), 1.7 (m, 2H), 2.1 (m, 2H), 2.85 (m, 2H), 3.2 (m, 1H), 3.45 (m, 1H), 3.84 (m, 1H), 4.2 (br s, 2H), 5.75 (m, 1H), 7.25-7.40 (m, 5H), 7.61 (s, 1H).

步驟 B: 4-[4-[4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-[[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]六氫吡啶之製備

於 4-[4-(4,5-二氫 -5-苯基 -3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶
 羧酸 1,1-二甲基乙酯 (意即實例 1 步驟 A 之產物) (0.815 克, 1.97
 毫莫耳) 在二氯甲烷 (50 毫升) 中之溶液內, 添加氯化氫在乙
 醚中之溶液 (2M, 10 毫升, 20 毫莫耳)。將反應混合物在室
 溫下攪拌 1 小時, 而得膠黏沉澱物。添加甲醇, 以溶解沉澱
 物, 並將反應混合物再攪拌 1 小時。使反應混合物在減壓下
 濃縮, 並於醋酸乙酯與飽和碳酸氫鈉水溶液之間作分液處
 理, 且使有機層脫水乾燥 (MgSO_4), 及濃縮, 而得自由態胺,
 為透明油 (0.31 克), 其係在靜置時固化。使所形成之自由態
 胺 (0.31 克, 1.0 毫莫耳)、5-甲基 -3-(三氟甲基)-1H-吡唑 -1-醋酸
 (0.208 克, 1.0 毫莫耳)、1-[3-(二甲胺基)丙基]-3-乙基碳化二亞
 胺鹽酸鹽 (0.25 克, 1.3 毫莫耳)、三乙胺 (150 微升, 1.08 毫莫
 耳) 及催化量之 1-羥基 -苯并三唑水合物 (~1 毫克) 在二氯甲
 烷 (5 毫升) 中之混合物漩渦打轉, 以形成渦旋, 並在室溫下
 保持 16 小時。將反應混合物以二氯甲烷 (10 毫升) 稀釋, 並
 以 1N 鹽酸水溶液與飽和碳酸氫鈉水溶液洗滌。使有機層脫
 水乾燥 (MgSO_4), 及在減壓下濃縮, 而得 0.47 克標題產物,
 為本發明之化合物, 為白色泡沫物。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.8 (m, 2H), 2.2 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.9 (m, 1H), 3.3
 (m, 2H), 3.42 (m, 1H), 3.85 (m, 1H), 4.05 (m, 1H), 4.55 (m, 1H), 4.98 (m,
 2H), 5.75 (m, 1H), 6.33 (s, 1H), 7.25-7.42 (m, 5H), 7.63 (s, 1H).

下列化合物係藉由類似實例 1 步驟 B 之程序製成:

1-[4-[4-(4,5-二氫 -5-苯基 -3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶
 基]-2-[3-甲基 -5-(三氟甲基)-1H-吡唑 -1-基]乙酮 (化合物 128); ^1H

NMR (CDCl₃) δ 1.7-1.9 (m, 2H), 2.16 (m, 1H), 2.24 (m, 1H), 2.29 (s, 3H), 2.84-2.92 (br t, 1H), 3.30 (m, 2H), 3.43 (m, 1H), 3.86 (m, 2H), 4.59 (br d, 1H), 5.04 (s, 2H), 5.75 (m, 1H), 6.47 (s, 1H), 7.29-7.39 (m, 5H), 7.64 (s, 1H).

5 1-[4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-乙基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮(化合物 19); m.p. (熔點) 128-133°C (自醋酸甲酯/石油醚結晶); ¹H NMR (CDCl₃) δ 1.28 (t, 3H), 1.8 (m, 2H), 2.2 (m, 2H), 2.62 (q, 2H), 2.9 (m, 1H), 3.3 (m, 2H), 3.42 (m, 1H), 3.85 (m, 1H), 4.05 (m, 1H), 4.55 (m, 1H), 4.98 (m, 2H), 5.75 (m, 1H), 6.33 (s, 1H), 7.25-7.42 (m, 5H), 7.63 (s, 1H).

10 2-[3,5-雙(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮(化合物 22); 熔點 130-133°C (自醋酸甲酯/石油醚結晶); ¹H NMR (CDCl₃) δ 1.8 (m, 2H), 2.2 (m, 2H), 2.9 (m, 1H), 3.3 (m, 2H), 3.42 (m, 1H), 3.85 (m, 2H), 4.55 (m, 1H), 5.10 (s, 2H), 5.77 (m, 1H), 6.95 (s, 1H), 7.25-7.42 (m, 5H), 7.64 (s, 1H).

15 1-[4-[4-(2,3-二氫螺[4H-1-苯并哌喃-4,5'(4'H)-異噁唑]-3'基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮(化合物 137); ¹H NMR (CDCl₃) δ 1.83 (m, 2H), 2.18 (m, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.42 (m, 1H), 2.90 (m, 1H), 3.31 (m, 2H), 3.47 (d, 1H), 3.83 (d, 1H), 4.05 (m, 1H), 4.27 (m, 1H), 4.40 (m, 1H), 4.58 (d, 1H), 4.97 (m, 2H), 6.33 (s, 1H), 6.87 (d, 1H), 6.95 (dd, 1H), 7.21 (dd, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.67 (s, 1H).

1-[4-[4-(2,3-二氫螺[4H-1-苯并硫代哌喃-4,5'(4'H)-異噁唑]-3'

基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮(化合物102); ^1H NMR (CDCl_3) δ 1.82 (m, 2H), 2.23 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.37 (m, 1H), 2.50 (m, 1H), 2.90 (m, 1H), 3.14 (m, 1H), 3.17 (m, 1H), 3.27 (m, 2H), 3.48 (d, 1H), 3.66 (d, 1H), 4.05 (m, 1H), 4.57 (d, 1H), 4.97 (m, 2H), 6.33 (s, 1H), 7.06 (m, 3H), 7.45 (d, 1H), 7.65 (s, 1H).

實例2

1-[[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]-4-[4-(5-苯基-3-異噁唑基)-2-噻唑基]六氫吡啶(化合物2)之製備

步驟A: 2-(4-六氫吡啶基)-4-噻唑羧醛單-鹽酸鹽之製備

於4-(4-甲醯基-2-噻唑基)-1-六氫吡啶羧酸1,1-二甲基乙酯(1.0克, 3.4毫莫耳)在二氯甲烷(20毫升)中之溶液內, 添加氯化氫在乙醚中之溶液(2.0毫升, 15毫升, 30毫莫耳)。將反應混合物於氮氣及室溫下攪拌2小時, 然後在減壓下蒸發, 而得1.2克標題化合物, 為白色固體。

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.31-2.38 (m, 2H), 2.44-2.50 (m, 2H), 3.11-3.20 (m, 2H), 3.36-3.44 (m, 1H), 3.57-3.65 (m, 2H), 8.14 (s, 1H), 10.01 (s, 1H).

步驟B: 4-(4-甲醯基-2-噻唑基)-1-[[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]六氫吡啶之製備

於5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-醋酸(0.8克, 3.8毫莫耳)在二氯甲烷(10毫升)中之溶液內, 添加氯化草醯(2.4克, 19.2毫莫耳)與兩滴N,N-二甲基甲醯胺, 而造成稍微放熱性。然後, 將反應混合物於回流下加熱15分鐘。在真空中濃縮反應混合物, 並使殘留物懸浮於四氫呋喃(10毫升)中, 且以

2-(4-六氫吡啶基)-4-噻唑羧醛單鹽酸鹽(意即實例2步驟A之產物)(1.1克, 5.1毫莫耳)在四氫呋喃(10毫升)中之溶液處理, 接著逐滴添加三乙胺(1.2克, 11.9毫莫耳)。將反應混合物在室溫下攪拌過夜, 然後於1N鹽酸水溶液與醋酸乙酯之間作分液處理。分離有機層, 並以另外之醋酸乙酯(2 x 30毫升)萃取水層。將合併之有機層以1N鹽酸水溶液、飽和碳酸氫鈉水溶液及鹽水洗滌。使有機層脫水乾燥(MgSO_4), 及在減壓下蒸發, 而得0.8克標題化合物, 為黃色油。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.79-1.90 (m, 2H), 2.18-2.29 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.87-2.94 (m, 1H), 3.28-3.40 (m, 2H), 4.05-4.15 (m, 1H), 4.56-4.64 (m, 1H), 4.99-5.02 (m, 2H), 6.35 (s, 1H), 8.12 (s, 1H), 10.01 (s, 1H).

步驟C: 4-[4-[(羥亞胺基)甲基]-2-噻唑基]-1-[[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]六氫吡啶之製備

於4-(4-甲醯基-2-噻唑基)-1-[[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]六氫吡啶(意即實例2步驟B之產物)(0.8克, 2.07毫莫耳)在乙醇(15毫升)中之溶液內, 添加羥胺(50%水溶液, 0.136克, 4.1毫莫耳), 並將反應混合物在室溫下攪拌10分鐘。使反應混合物在減壓下濃縮, 而得黃色油, 使其在矽膠上藉急驟式管柱層析純化, 使用己烷中之50%醋酸乙酯作為溶離劑, 而得0.7克標題化合物, 為白色固體。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.72-1.85 (m, 2H), 2.17-2.27 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.82-2.91 (m, 1H), 3.25-3.37 (m, 2H), 4.02-4.09 (m, 1H), 4.58-4.63 (m, 1H), 4.95-5.03 (m, 2H), 6.35 (s, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.71 (s, 1H), 8.19 (s, 1H).

步驟 D: 1-[[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]-4-[4-(5-苯基-3-異噁唑基)-2-噁唑基]六氫吡啶之製備

使 4-[4-[(*trans*-亞胺基)甲基]-2-噁唑基]-1-[[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]六氫吡啶(意即實例 2 步驟 C 之產物)(0.2 克, 0.5 毫莫耳)懸浮於四氫呋喃(20 毫升)中, 並添加苯乙炔(1.1 毫升, 1 毫莫耳), 接著緩慢逐滴添加 Clorox® 漂白劑溶液(6.15 重量%次氯酸鈉, 10 毫升), 歷經 1 小時。使反應混合物於飽和碳酸氫鈉水溶液與醋酸乙酯之間作分液處理。分離有機層, 並以醋酸乙酯(3 x 30 毫升)萃取水層。將合併之有機層以鹽水洗滌, 脫水乾燥(MgSO₄), 及在減壓下濃縮, 而得油, 使其在矽膠上藉急驟式管柱層析純化, 使用醋酸乙酯中之 10% 甲醇作為溶離劑, 而得 70 毫克標題產物, 為本發明之化合物, 為透明黃色油。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.80-1.92 (m, 2H), 2.22-2.32 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.90-2.98 (m, 1H), 3.31-3.41 (m, 2H), 4.05-4.11 (m, 1H), 4.58-4.65 (m, 1H), 4.97-5.07 (m, 2H), 6.36 (s, 1H), 6.98 (s, 1H), 7.47-7.53 (m, 3H), 7.84 (s, 2H), 7.88 (m, 1H).

實例 3

4-[4-(4,5-二氫-1-甲基-5-苯基-1H-咪唑-2-基)-2-噁唑基]-1-[[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]六氫吡啶(化合物 7)之製備

於 4-(4-甲醯基-2-噁唑基)-1-[[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]六氫吡啶(意即實例 2 步驟 B 之產物)(0.8 克, 2.07 毫莫耳)在第三-丁醇(5 毫升)中之溶液內, 添加 N¹-甲基-1-苯基-1,2-乙二胺(43.57 毫克, 0.29 毫莫耳)。將反應混合物在

室溫及氮大氣下攪拌 30 分鐘，然後添加碳酸鉀(107.8 毫克，0.78 毫莫耳)與碘(43.57 毫克，0.33 毫莫耳)。將反應混合物在 70°C 下攪拌 3 小時，接著，藉由添加飽和亞硫酸鈉水溶液使反應淬滅，直到碘顏色幾乎消失為止。以氯仿萃取反應混合物，並以飽和碳酸氫鈉水溶液與鹽水洗滌有機層，脫水乾燥(Na_2SO_4)，過濾，及濃縮。使殘留物於矽膠上藉預備之薄層層析法純化，使用 94% 醋酸乙酯、5% 甲醇及 1% 三乙胺之混合物作為溶離劑，而得 64 毫克標題產物，為本發明化合物，為油狀物。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.72-1.87 (m, 2H), 2.15-2.28 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.86-2.92 (m, 1H), 2.97 (s, 3H), 3.26-3.37 (m, 2H), 3.62-4.39 (m, 2H), 4.0-4.6 (m, 2H), 4.93-5.05 (m, 2H), 6.31 (s, 1H), 7.30-7.41 (m, 5H), 7.88 (s, 1H).

實例 4

4-[4-(4,5-二氫-3-苯基-5-異呔唑基)-2-噻唑基]-1-[(5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基)乙醯基]六氫吡啶(化合物 6)之製備
步驟 A： 4-(4-乙烯基-2-噻唑基)-1-六氫吡啶羧酸 1,1-二甲基乙酯之製備

於溴化甲基三苯基鏷(1.2 克，3.3 毫莫耳)在四氫呋喃(5 毫升)中之冷(-50°C)懸浮液內，添加鈉雙(三甲基矽烷基)-胺溶液(3.4 毫升，3.4 毫莫耳)，並將所形成之混合物在室溫下攪拌 1 小時。使所形成之混濁黃色溶液再冷卻至 -30°C，並添加 4-(4-甲醯基-2-噻唑基)-1-六氫吡啶羧酸 1,1-二甲基乙酯(0.5 克，1.68 毫莫耳)。將所形成之微黃色溶液於室溫下攪拌 3

小時，然後以水稀釋，及以醋酸乙酯萃取。以鹽水洗滌有機層，脫水乾燥(MgSO₄)，過濾，並於矽膠上藉管柱層析純化，使用己烷中之15-30%醋酸乙酯作為溶離劑，而得471毫克標題化合物，為無色油。

5 ¹H NMR (CDCl₃) δ 1.47 (s, 9H), 1.68 (m, 2H), 2.10 (m, 2H), 2.88 (m, 2H), 3.15 (m, 1H), 4.18 (m, 2H), 5.34 (d, 1H), 6.02 (d, 1H), 6.68 (dd, 1H), 6.99 (s, 1H).

步驟 B： 4-(4-乙 烯 基 -2-噻 唑 基)六 氫 吡 啶 之 製 備

10 於 4-(4-乙 烯 基 -2-噻 唑 基)-1-六 氫 吡 啶 羧 酸 1,1-二 甲 基 乙 酯 (意 即 實 例 4 步 驟 A 之 產 物) (471 毫 克，1.6 毫 莫 耳) 在 二 氯 甲 烷 (5 毫 升) 中 之 溶 液 內，添 加 氯 化 氫 在 乙 醚 中 之 溶 液 (2.0M，7 毫 升，14 毫 莫 耳)。將 反 應 混 合 物 於 氮 氣 及 室 溫 下 攪 拌 4 小 時，然 後 添 加 1N 氫 氧 化 鈉 水 溶 液，直 到 反 應 混 合 物 之 pH 值 增 加 至 約 10 為 止。將 所 形 成 之 混 合 物 以 二 氯 甲 烷 萃 取

15 (2x)。合 併 有 機 層，以 鹽 水 洗 滌，脫 水 乾 燥 (MgSO₄)，過 濾，及 在 真 空 中 濃 縮，而 得 302 毫 克 標 題 化 合 物，為 油 狀 物。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.70 (m, 2H), 1.82 (br s, 1H), 2.12 (br d, 2H), 2.76 (br t, 2H), 3.11 (m, 1H), 3.18 (m, 2H), 5.32 (d, 1H), 6.02 (d, 1H), 6.70 (dd, 1H), 6.99 (s, 1H).

20 步 驟 C： 4-(4-乙 烯 基 -2-噻 唑 基)-1-[[5-甲 基 -3-(三 氟 甲 基)-1H-吡 唑 -1-基]乙 醯 基]六 氫 吡 啶 之 製 備

於 5-甲 基 -3-(三 氟 甲 基)-1H-吡 唑 -1-醋 酸 (0.5 克，2.4 毫 莫 耳) 在 二 氯 甲 烷 (4 毫 升) 中 之 溶 液 內，添 加 氯 化 草 醯 (0.3 毫 升，3.6 毫 莫 耳) 與 一 滴 N,N-二 甲 基 甲 醯 胺，而 造 成 稍 微 放 熱 性。

然後，將反應混合物於回流下加熱15分鐘。蒸發反應混合物，並使所形成之殘留物懸浮於二氯甲烷(4毫升)中，且以4-(4-乙烯基-2-噻唑基)六氫吡啶(意即實例4步驟B之產物)(302毫克，1.5毫莫耳)在二氯甲烷(2毫升)中之溶液處理，
 5 接著添加三乙胺(0.32毫升，2.3毫莫耳)。將反應混合物於室溫下攪拌過夜，然後濃縮，並於矽膠上藉管柱層析純化，使用己烷中之30-40%醋酸乙酯作為溶離劑，而得414毫克標題化合物，為白色固體。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.78 (m, 2H), 2.18 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.90 (br t, 1H), 3.30 (m, 2H), 4.03 (d, 1H), 4.55 (d, 1H), 5.00 (m, 2H), 5.35 (d, 1H),
 10 6.02 (d, 1H), 6.33 (s, 1H), 6.68 (dd, 1H), 7.01 (s, 1H).

步驟D： 4-[4-(4,5-二氫-3-苯基-5-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-[(5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基)乙醯基]六氫吡啶之
 製備

15 於苯甲醛肟(49毫克，0.4毫莫耳)在N,N-二甲基甲醯胺(3毫升)中之溶液內，添加N-氯基琥珀醯亞胺(54毫克，0.4毫莫耳)，接著添加4-(4-乙烯基-2-噻唑基)-1-[(5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基)乙醯基]六氫吡啶(意即實例4步驟C之產物)(103毫克，0.27毫莫耳)與三乙胺(41毫克，0.4毫莫耳)。
 20 將所形成之混合物於室溫下攪拌5小時，然後以水稀釋，以二氯甲烷萃取(2x)。合併有機層，並脫水乾燥(MgSO₄)，及過濾。濃縮濾液，並使殘留物於矽膠上藉管柱層析純化，使用己烷中之55-70%醋酸乙酯作為溶離劑，而得90毫克標題產物，為本發明化合物，為白色固體。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76 (m, 2H), 2.17 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.88 (br t, 1H), 3.25 (m, 2H), 3.65 (m, 1H), 3.78 (m, 1H), 4.02 (br d, 1H), 4.56 (br d, 1H), 4.99 (m, 2H), 5.84 (dd, 1H), 6.32 (s, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.40-7.42 (m, 3H), 7.69-7.71 (m, 2H).

5

實例 5

1-[4-[4-[5-(2-氯苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-
六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮
(化合物 8) 之製備

於 1-氯基-2-乙基苯 (0.035 克, 0.25 毫莫耳)、三乙胺 (2.5
毫克, 0.025 毫莫耳) 及 Clorox[®] 次氯酸鈉水溶液 (1 毫升, 16.1
毫莫耳) 在二氯甲烷 (5 毫升) 中之溶液內, 於 0°C 下, 逐滴添
加二氯甲烷 (5 毫升) 中之 4-[4-[(經亞胺基)甲基]-2-噻唑基]-1-
[[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]六氫吡啶 (意即
實例 2 步驟 C 之產物) (0.10 克, 0.25 毫莫耳), 歷經 1 小時。將
反應混合物攪拌 1 小時, 然後經過 Celite[®] 矽藻土助濾劑過
濾, 及在減壓下濃縮, 而得油, 使其在矽膠上藉管柱層析
純化, 使用己烷中之 50% 醋酸乙酯作為溶離劑, 而得 73 毫
克標題化合物, 為白色泡沫物, 於 115-122°C 下溶解 (自醋酸
甲酯/石油醚結晶)。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.74-1.80 (m, 2H), 2.14-2.22 (m, 2H), 2.32 (s, 3H),
2.85-2.91 (m, 1H), 3.26-3.30 (m, 2H), 3.31-3.32 (m, 1H), 4.05-4.07 (m,
1H), 4.55-4.58 (m, 1H), 4.93-5.03 (q, 2H), 6.01-6.06 (m, 1H), 6.331 (s, 1H),
7.25-7.29 (m, 2H), 7.38-7.40 (m, 1H), 7.56-7.58 (m, 1H), 7.62 (s, 1H).

實例 6

1-[4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-
六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙烷硫酮
(化合物 130)之製備

5 將 4-[4-[4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-[[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙基]六氫吡啶(意即實例 1 步驟 B 之產物)(235 毫克, 0.47 毫莫耳)與五硫化磷(104.5 毫克, 0.235 毫莫耳)在吡啶(5 毫升)中之溶液, 於回流下加熱 2 小時。然後, 在減壓下濃縮反應混合物, 並使殘留物於二氯
10 甲烷(10 毫升)與水(10 毫升)之間分配。以 1N 鹽酸、水、飽和碳酸氫鈉水溶液及鹽水洗滌有機層, 脫水乾燥(MgSO₄), 及在減壓下濃縮, 而得 240 毫克標題產物, 為本發明化合物, 為白色泡沫物。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.80-2.00 (m, 2H), 2.20-2.28 (m, 2H), 2.45 (s, 3H),
15 3.35-3.46 (3H, m), 3.50-3.61 (m, 1H), 3.80-3.88 (m, 1H), 4.70-4.80 (m, 1H), 5.30-5.33 (m, 2H), 5.35-5.40 (m, 1H), 5.74-5.80 (m, 1H), 6.32 (s, 1H), 7.30-7.40 (m, 5H), 7.65 (s, 1H).

實例 7

1-[4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-
20 六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮
(化合物 154)之製備

步驟 A: 4-(胺基硫酮基甲基)-1-六氫吡啶-羧酸 1,1-二甲基
乙酯之製備

於硫代羰基二咪唑(2.1 克, 11.8 毫莫耳)在四氫呋喃(30 毫

升)中之溶液內，在室溫下添加1-六氫吡咩羧酸1,1-二甲基乙酯(2克，10.75毫莫耳)。將反應混合物於室溫下攪拌2小時，然後加熱至55°C，歷經另外2小時。使反應混合物冷卻至室溫，及在減壓下濃縮，直到大約20毫升四氫呋喃留下為止。

5 接著，將殘留物以氨在甲醇中之2M溶液(10毫升)處理，並於室溫下攪拌24小時。在減壓下濃縮反應混合物，並將殘留物以乙醚(25毫升)研製，而得白色沉澱物。過濾沉澱物，並乾燥，而得1.5克標題化合物，為白色固體。

10 $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 1.39 (s, 9H), 3.32 (m, 4H), 3.73 (m, 4H), 7.49 (br s, 2H).

√ 步驟B： 氯化3-氯-N-羥基-2-酮基-丙醯亞胺醯之製備

於1,3-二氯丙酮(100克，0.79莫耳)在氯化氫於乙醚中之2M溶液(400毫升)中之溶液內，在15°C下，添加亞硝酸第三-丁酯(55克，0.534莫耳)，歷經10分鐘。藉由 $^1\text{H NMR}$ 監測反應進展，獲得~85%轉化率，具有未超過3%之雙-亞硝化副產物。使反應混合物在減壓下濃縮，留下半固體，然後，將其以n-BuCl充分沖洗。將所形成之固體於過濾下收集，而得77克標題化合物，為白色固體。使濾液在減壓下進一步濃縮，而得半固體殘留物，將其以另外之n-BuCl沖洗。於過濾下收集所形成之固體，而得另外之15克標題化合物，為白色固體。

$^1\text{H NMR}$ (DMSO-d_6) δ 4.96 (s, 2H), 13.76 (s, 1H).

√ 步驟C： 2-氯基-1-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基)乙酮之製備

於苯乙烯(6.79克，65.3毫莫耳)與碳酸氫鈉(32.1克，粉末)

在乙腈(100 毫升)中之混合物內，以 10 份添加氯化 3-氯 -N-羥基 -2-酮基 -丙醯亞胺醯(意即實例 7 步驟 B 之產物)(10 克，64.1 毫莫耳)，歷經 20 分鐘。然後，將反應混合物再攪拌 1 小時，及過濾。將已過濾之固體以乙腈沖洗，在減壓下濃縮合併之濾液，留下油，將其首先以己烷，接著以 1-氯基丁烷研製，而得 13.6 克標題化合物，為白色固體。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 3.13 (m, 1H), 3.66 (m, 1H), 4.96 (s, 2H), 5.83 (m, 1H), 7.34-7.44 (m, 5H).

步驟 D: 4-[4-(4,5-二氫 -5-苯基 -3-異呔唑基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶醋酸 1,1-二甲基乙酯之製備

於 2-氯基 -1-(4,5-二氫 -5-苯基 -3-異呔唑基)乙酮(意即實例 7 步驟 C 之產物)(0.450 克，2.018 毫莫耳)與 4-(胺基 -硫酮基甲基)-1-六氫吡啶羧酸 1,1-二甲基乙酯(意即實例 7 步驟 A 之產物)(0.5 克，2.04 毫莫耳)在乙醇(10 毫升)中之溶液內，添加三乙胺(0.204 克，2.013 毫莫耳)，並將反應混合物在室溫下攪拌 12 小時。在減壓下濃縮反應混合物，並使殘留物於醋酸乙酯(30 毫升)與水(30 毫升)之間作分液處理。分離有機層，並以鹽水(25 毫升)洗滌，脫水乾燥(Na_2SO_4)，及在減壓下濃縮。使粗製殘留物藉管柱層析純化，使用石油醚中之 20% 醋酸乙酯作為溶離劑，而得 700 毫克標題化合物，為白色固體。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 1.48 (s, 9H), 3.30 (m, 1H), 3.54 (m, 8H), 3.74 (m, 1H), 5.71 (m, 1H), 6.91 (s, 1H), 7.40-7.29 (m, 5H).

步驟 E： 1-[4-(4,5-二氫 -5-苯基 -3-異噁唑基)-2-噻唑基]-六氫
吡咩鹽酸鹽之製備

於 4-[4-(4,5-二氫 -5-苯基 -3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-六氫吡咩
醋酸 1,1-二甲基乙酯 (意即實例 7 步驟 D 之產物) (0.7 克 , 1.686
5 毫莫耳) 在乙醚 (10 毫升) 中之溶液內 , 在室溫下添加氯化氫
在甲醇中之 2M 溶液 (10 毫升) 。將反應混合物在室溫下攪拌
8 小時。過濾所形成之白色沉澱物 , 並乾燥 , 而得 500 毫克
標題化合物 , 為白色固體。

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.21 (m, 4H), 3.27 (m, 1H), 3.68 (m, 4H), 3.79 (m,
10 1H), 5.68 (m, 1H), 7.41-7.29 (m, 6H), 9.49 (br s, 2H).

步驟 F： 1-[4-[4-(4,5-二氫 -5-苯基 -3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-六
氫吡咩基]-2-[5-甲基 -3-(三氟甲基)-1H-吡唑 -1-基]乙
酮之製備

於 1-[4-(4,5-二氫 -5-苯基 -3-異噁唑基)-2-噻唑基]六氫吡咩鹽
15 酸鹽 (意即實例 7 步驟 E 之產物) (200 毫克 , 0.57 毫莫耳) 與 5-
甲基 -3-(三氟甲基)-1H-吡唑 -1-醋酸 (0.120 克 , 0.57 毫莫耳) 在二
氯甲烷 (10 毫升) 中之溶液內 , 在室溫下 , 添加 1-[3-(二甲胺基)
丙基]-3-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽 (0.110 克 , 0.57 毫莫耳) 、三乙
胺 (0.086 克 , 0.85 毫莫耳) 及 1-羥基 -苯并三唑水合物 (0.020 克 ,
20 0.14 毫莫耳) 。將反應混合物於室溫下攪拌 24 小時。以二氯
甲烷 (30 毫升) 稀釋反應混合物 , 並以水 (20 毫升) 與鹽水 (20
毫升) 洗滌。使有機層脫水乾燥 (Na_2SO_4) , 及在減壓下濃縮。
使粗製殘留物藉管柱層析純化使用氯仿中之 3% 甲醇作為
溶離劑 , 而得 180 毫克標題產物 , 為本發明化合物 , 為白色

固體。

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.32 (s, 3H), 3.29 (m, 1H), 3.52 (m, 2H), 3.61 (m, 2H), 3.79-3.72 (m, 5H), 4.98 (m, 2H), 5.69 (m, 1H), 6.33 (s, 1H), 6.93 (s, 1H), 7.38-7.28 (m, 5H).

5 質譜在 505.5 ($\text{M}+1$) 下。

實例 8

1-[4-[4-(3',4'-二氫螺[異噁唑-5(4H),1',(2'H)-蔡]-3-基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮(化合物 37)之製備

10 步驟 A： 1-(2-氯基乙醯基)-4-六氫吡啶甲腈之製備

使 4-六氫吡啶甲腈(200 克，1.80 莫耳)與 40% 碳酸鉀水溶液(342 克，0.99 莫耳)在二氯甲烷(1 升)中之混合物冷卻至 -10°C ，並添加氯化氯乙醯(210 克，1.86 莫耳)在二氯甲烷(300 毫升)中之溶液，歷經約 75 分鐘，同時保持反應混合物於 -10 至 0°C 下。在添加完成後，分離反應混合物，以二氯甲烷(2 x 300 毫升)萃取上層水相，並使合併之有機相在減壓下濃縮，而得 312 克標題化合物，為液體，其係在靜置時慢慢結晶。此化合物具有足夠純度，以使用於後續反應中。

15 ^1H NMR (CDCl_3) δ 1.8-2.1 (m, 4H), 2.95 (m, 1H), 3.5-3.8 (m, 4H), 4.08 (q, 2H).

20 步驟 A1： 1-(2-氯基乙醯基)-4-六氫吡啶甲腈之替代製備

使 N-(1,1-二甲基乙基)-4-六氫吡啶羧醯胺(201 克，1.0 莫耳)在二氯甲烷(1 升)中之溶液，於氮氣下冷卻至 -5°C ，並逐滴添加 300 毫升二氯甲烷中之氯化氯乙醯(124 克，1.1 莫耳)，

歷經 30 分鐘，同時保持反應混合物於 0 至 5°C 下。接著逐滴添加 20% 碳酸鉀水溶液 (450 克，0.65 莫耳)，歷經 30 分鐘，同時保持反應溫度在 0 與 5°C 之間。將反應混合物於 0°C 下攪拌另外 30 分鐘，然後使其溫熱至室溫。分離液層，並以二氯
 5 甲烷 (200 毫升) 萃取水層。使合併之二氯甲烷層在減壓下濃縮，而產生固體，將其以 400 毫升己烷研製。過濾漿液，並以 100 毫升己烷洗滌濾餅，及在真空烘箱中，於 50°C 下乾燥過夜，而得 185.5 克 1-(2-氯基乙醯基)-N-(1,1-二甲基乙基)-4-六
 氫吡啶羧醯胺，為固體，於 140.5-141.5°C 下熔解。

10 $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 1.35 (s, 9H), 1.6-2.0 (m, 4H), 2.25 (m, 1H), 2.8 (t, 1H), 3.2 (t, 1H), 3.9 (d, 1H), 4.07 (s, 2H), 4.5 (d, 1H), 5.3 (br s, 1H).

於 1-(2-氯基乙醯基)-N-(1,1-二甲基乙基)-4-六氫吡啶羧醯胺 (26.1 克，0.10 莫耳) 在 N,N-二甲基甲醯胺 (35 毫升) 中之溶液內，逐滴添加氯化磷醯 (18.8 克，0.123 莫耳)，歷經 30 分鐘，
 15 同時使反應混合物之溫度上升至 37°C。將反應混合物在 55°C 下加熱 1 小時，然後慢慢添加至水 (約 150 克) 中，使用冰冷卻，以保持溫度為約 10°C。將反應混合物之 pH 值以 50% NaOH 水溶液調整至 5.5。以二氯甲烷 (4 x 100 毫升) 萃取混合物，並使合併之萃液在減壓下濃縮，而得 18.1 克標題化合物，
 20 為固體。此化合物具有足夠純度，以使用於後續反應中。

步驟 B： 1-[2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙醯基]-4-
 六氫吡啶甲腈之製備

使 3-甲基-5-三氟甲基吡啶 (9.3 克，62 毫莫耳) 與 45% 氫氧化鉀水溶液 (7.79 克，62 毫莫耳) 在 N,N-二甲基甲醯胺 (25 毫升)

中之溶液冷卻至 5°C，並添加 1-(2-氯基乙醯基)-4-六氫吡啶甲腈(意即實例 8 步驟 A 或 A1 之產物) (11.2 克，60 毫莫耳)。將反應混合物於 5-10°C 下攪拌 8 小時，然後以水(100 毫升)稀釋，並過濾。以水洗滌濾餅，並在 50°C 下，於真空烘箱中乾燥，而得 15 克標題化合物，為固體，含有 3% 其區域異構物，意即 1-[2-[3-甲基-5-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙醯基]-4-六氫吡啶甲腈。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.88 (m, 4H), 2.32 (s, 3H), 2.95 (m, 1H), 3.7 (m, 4H), 5.0 (q, 2H), 6.34 (s, 1H).

步驟 C： 1-[2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙醯基]-4-六氫吡啶碳硫醯胺之製備

於 50°C 下，在裝有乾冰冷凝器之燒瓶中，使硫化氫氣體通入 1-[2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙醯基]-4-六氫吡啶甲腈(意即實例 8 步驟 B 之產物) (9.0 克，30 毫莫耳)與二乙醇胺(3.15 克，30 毫莫耳)在 N,N-二甲基甲醯胺(15 毫升)中之溶液內。當反應混合物以硫化氫變成飽和時，如藉由在冷手指上凝結所指示，即停止硫化氫進料。將反應混合物於 50°C 下再攪拌 30 分鐘。然後，使過量硫化氫氣體藉由液面下氮流動，噴射進入洗氣器中，並慢慢添加水(70 毫升)。使反應混合物冷卻至 5°C，過濾，及以水(2 x 30 毫升)洗滌。使濾餅於 50°C 下，在真空烘箱中乾燥，而得 8.0 克標題化合物，為固體，於 185-186°C 下溶解。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.7 (m, 2H), 2.0 (m, 2H), 2.29 (m, 3H), 2.65 (t, 1H), 3.0 (m, 3H), 3.2 (t, 1H), 4.0 (d, 1H), 4.6 (d, 1H), 4.96 (d, 1H), 5.4 (d, 1H),

6.35 (s, 1H), 7.4 (br s, 1H), 7.5 (br s, 1H).

步驟 D： 1-[4-[4-(3',4'-二氫螺[異喹啉-5(4H),1',(2'H)-蔡]-3-基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙酮之製備

5 將 1-[2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙醯基]-4-六氫吡啶-碳硫醯胺(意即實例 8 步驟 C 產物) (0.5 克, 1.5 毫莫耳)、
2-氯基-1-(3',4'-二氫螺[異喹啉-5(4H),1',(2'H)-蔡]-3-基)乙酮(經由
類似實例 7 步驟 C 之方法製成) (0.4 克, 1.5 毫莫耳)及四丁基
10 溴化銨(0.030 克, 0.10 毫莫耳)在四氫呋喃(15 毫升)中之溶
液, 於室溫下攪拌過夜, 然後在 55-60°C 下加熱 3 小時。將反
應混合物以水稀釋, 並以二氯甲烷萃取。以鹽水洗滌萃液,
脫水乾燥(MgSO₄), 及在減壓下濃縮。使粗產物藉由中壓液
相層析法進一步純化, 使用己烷中之 50% 醋酸乙酯作為溶
離劑, 而得 260 毫克標題產物, 為本發明化合物, 為灰白色
15 固體, 於 81-84°C 下熔解。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.76-1.86 (m, 3H), 2.04-2.08 (m, 2H), 2.16-2.26 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.83-2.87 (m, 2H), 2.88-2.93 (m, 1H), 3.27-3.35 (m, 2H), 3.48-3.65 (m, 2H), 4.02-4.06 (m, 1H), 4.55-4.59 (m, 1H), 4.94-5.04 (q, 2H), 6.33 (s, 1H), 7.10-7.12 (m, 1H), 7.19-7.21 (m, 2H), 7.40-7.43 (m, 1H), 7.62 (s, 1H).

下述化合物係藉由類似實例 8 步驟 D 之程序製成：

1-[4-[4-(4,5-二氫-5-甲基-5-苯基-3-異喹啉基)-2-噻唑基]-1-六
氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙酮(化合物
15)；熔點 97-100°C (自醋酸甲酯/石油醚結晶)；

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.74-1.80 (m, 1H), 1.81 (s, 3H), 2.14-2.20 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.85-2.91 (m, 1H), 3.26-3.32 (m, 2H), 3.52-3.62 (m, 2H), 4.01-4.05 (m, 1H), 4.54-4.58 (m, 1H), 4.94-5.04 (q, 2H), 6.33 (s, 1H), 7.26-7.29 (m, 1H), 7.35-7.38 (m, 2H), 7.48-7.50 (m, 2H), 7.58 (s, 1H).

5 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-(3a,4,5,9b-四氫-蔡[2,1-d]異喹啉-3-基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮(化合物 16); 熔點 162-165°C (自醋酸甲酯/石油醚結晶);

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.79-1.85 (m, 2H), 2.00-2.05 (m, 2H), 2.20-2.26 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.68-2.72 (m, 2H), 2.88-2.94 (m, 1H), 3.30-3.35 (m, 2H), 10 3.92-3.98 (m, 1H), 4.06-4.10 (m, 1H), 4.58-4.60 (m, 1H), 4.94-5.06 (m, 2H), 5.58-5.60 (d, 1H), 6.34 (s, 1H), 7.17-7.20 (m, 1H), 7.28-7.30 (m, 2H), 7.47-7.49 (m, 1H), 7.72 (s, 1H).

1-[4-[4-(2,3-二氫螺[1H-茛-1,5'(4'H)-異喹啉]-3'基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮(化合物 15 44);

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.77-1.84 (m, 2H), 2.17-2.25 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.61-2.68 (m, 1H), 2.90-2.96 (m, 2H), 3.12-3.20 (m, 1H), 3.31-3.35 (m, 2H), 3.54-3.75 (m, 2H), 4.04-4.10 (m, 1H), 4.56-4.60 (m, 1H), 4.94-5.04 (q, 2H), 6.34 (s, 1H), 7.28-7.30 (m, 3H), 7.37-7.38 (m, 1H), 7.64 (s, 1H).

20 1-[4-[4-[4,5-二氫-5-(4-甲氧苯基)-3-異喹啉基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮(化合物 18); 熔點 119-124°C (自醋酸甲酯/石油醚結晶);

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.76-1.82 (m, 2H), 2.16-2.24 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.86-2.92 (m, 1H), 3.28-3.34 (m, 2H), 3.37-3.43 (m, 1H), 3.76-3.83 (m,

1H), 3.81 (s, 3H), 4.03-4.06 (m, 1H), 4.56-4.59 (m, 1H), 4.94-5.04 (q, 2H), 5.67-5.72 (m, 1H), 6.33 (s, 1H), 6.89-6.91 (d, 2H), 7.31-7.33 (d, 2H), 7.62 (s, 1H).

實例 9

5 1-[4-[4-(4,5-二氫-5-(2-吡啶基)-3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮

(化合物 98) 之製備

於 1-[2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]-4-六氫吡啶碳硫醯胺 (意即實例 8 步驟 C 之產物) (200 毫克, 0.6 毫莫耳) 在四氫呋喃 (8 毫升) 中之溶液內, 添加氯化 3-氯-N-羥基-2-酮基丙醯亞胺醯 (意即實例 7 步驟 B 之產物) (93 毫克, 0.6 毫莫耳), 接著為四丁基溴化銨 (15 毫克, 0.05 毫莫耳)。將反應混合物在 50°C 下加熱 4 小時。使反應混合物冷卻, 及於減壓下濃縮。於所形成之殘留物中, 添加乙腈 (8 毫升) 與微細
10 粉末狀碳酸氫鈉 (151 毫克, 1.0 毫莫耳), 接著為 2-乙烯基吡啶 (63 毫克, 0.6 毫莫耳), 並將所形成之混合物於室溫下攪拌過夜。使反應混合物在減壓下濃縮, 並於 20 克矽膠 Varian Bond Elute SI® 管柱上藉急驟式層析純化, 使用己烷中之 0 至 75% 醋酸乙酯作為溶離劑, 而得 80 毫克標題產物, 為本發明化合物, 為黃色半固體。
15 20

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.47-1.62 (m, 1H), 1.70-1.85 (m, 1H), 2.01-2.18 (m, 2H), 2.49 (s, 3H), 2.82 (t, 1H), 3.20-3.42 (m, 2H), 3.73 (dd, 1H), 3.82 (dd, 1H), 3.98 (d, 1H), 4.38 (d, 1H), 5.26 (m, 2H), 5.80 (dd, 1H), 6.50 (s, 1H), 7.38 (dd, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.82 (t, 1H), 8.05 (s, 1H), 8.60 (d, 1H).

實例 10

2-[5-氯基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮(化合物 107)之製備
步驟 A: N,N-二甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-磺醯胺之製備

5 於 3-三氟甲基吡唑 (5.0 克, 36 毫莫耳)、三乙胺 (7.0 毫升, 50 毫莫耳) 在二氯甲烷 (40 毫升) 中之溶液內, 添加氯化二甲基胺磺醯 (5.5 毫升, 51 毫莫耳), 並將反應混合物於回流下加熱 2 天。使所形成之混合物冷卻至環境溫度, 並經過矽膠墊片過濾, 使用二氯甲烷作為溶離劑。然後於減壓下濃縮
10 濾液, 而得琥珀色殘留物。使所形成之殘留物溶於乙醚中。將此醚溶液以水洗滌, 脫水乾燥 (MgSO_4), 及在減壓下濃縮, 而得 8.71 克標題化合物。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 3.01 (s, 6H), 6.65 (s, 1H), 8.03 (s, 1H).

15 步驟 B: 5-氯-N,N-二甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-磺醯胺之製備

使 N,N-二甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-磺醯胺 (意即實例 10 步驟 A 之產物) (4.0 克, 16 毫莫耳) 在四氫呋喃 (25 毫升) 中之經攪拌溶液冷卻至 -78°C , 然後以環己烷中之 2M 正-丁基鋰 (8.6 毫升, 17.2 毫莫耳) 逐滴處理。將反應混合物再攪拌 30
20 分鐘, 接著, 逐滴添加六氯乙烷 (4.2 克, 18 毫莫耳) 在四氫呋喃 (15 毫升) 中之溶液。將反應混合物攪拌 1 小時, 溫熱至室溫, 並以水 (50 毫升) 使反應淬滅。以二氯甲烷萃取所形成之溶液, 脫水乾燥 (MgSO_4), 及在減壓下濃縮, 而得 4.38 克標題化合物。此化合物具有足夠純度, 以使用於後續反

應中。

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.15 (s, 6H), 6.58 (s, 1H).

步驟 C： 5-氯基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶之製備

將 5-氯-N,N-二甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-磺醯胺 (意即實
5 例 10 步驟 B 之產物) (4.38 克, 15.8 毫莫耳) 與三氟醋酸 (2.7 毫
升, 35 毫莫耳) 之溶液, 在 0°C 下攪拌 1.5 小時。以水 (15 毫升)
稀釋反應混合物, 並添加碳酸鈉, 以提升 pH 至 12。將溶液
以乙醚萃取, 脫水乾燥 (MgSO_4), 及在減壓下濃縮, 而得 2.1
克標題化合物。此化合物具有足夠純度, 以使用於後續反
10 應中。

^1H NMR (CDCl_3) δ 6.57 (m, 1H).

步驟 D： 5-氯基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-醋酸乙酯之製備

於 5-氯基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶 (意即實例 10 步驟 C 之產
物) (2.1 克, 12.3 毫莫耳) 與碳酸鉀 (3.6 克, 26.0 毫莫耳) 在 20
15 毫升 N,N-二甲基甲醯胺中之懸浮液內, 添加溴醋酸乙酯 (2.1
毫升, 18.8 毫莫耳), 並將所形成之混合物於室溫下攪拌 12
小時。將所形成之混合物以醋酸乙酯稀釋, 以水洗滌, 及
脫水乾燥 (MgSO_4)。使反應混合物在真空中濃縮, 及藉由中
壓液相層析法進一步純化, 使用己烷中之 0-50% 醋酸乙酯作
20 為溶離劑, 而得 940 毫克標題化合物, 為油狀物。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.29 (m, 3H), 4.27 (q, 2H), 4.96 (m, 2H), 6.55 (s, 1H).

步驟 D1： 5-氯基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-醋酸乙酯之替代製備

於氯化鋁 (3.0 克, 22.5 毫莫耳) 在二氯甲烷 (100 毫升) 中之
溶液內, 逐滴添加氯化三氟乙醯 (3 克, 22.6 毫莫耳) 在二氯

甲烷(5 毫升)中之溶液，同時保持反應混合物之溫度低於 -30 °C。將反應混合物在 -50°C 下攪拌 15 分鐘。然後，將二氯亞乙烯(2.2 克，22.7 毫莫耳)在二氯甲烷(10 毫升)中之溶液逐滴添加至反應混合物中，歷經 2 小時。將反應混合物於 -50°C 下再攪拌 2 小時，接著逐漸溫熱至室溫。以水稀釋反應混合物，並以二氯甲烷萃取水層。合併有機層，脫水乾燥(MgSO₄)，及在減壓下濃縮，而得 4,4-二氯 -1,1,1-三氟 -3-丁烯 -2-酮，為油狀物，將其使用於下一步驟，無需進一步純化。

¹H NMR (CDCl₃) δ 5.30 (s, 1H).

¹⁹F NMR (CDCl₃) δ -63.6.

於肼基醋酸乙酯鹽酸鹽(2.8 克，18.1 毫莫耳)與三乙胺(9.2 克，91 毫莫耳)在乙醇(20 毫升)與 N,N-二甲基甲醯胺(1 毫升)之溶液中之混合物內，逐滴添加粗製 4,4-二氯 -1,1,1-三氟 -3-丁烯 -2-酮在二氯甲烷中之溶液(20 毫升)，同時保持反應混合物之溫度低於 10°C。在低於 10°C 下再攪拌 2 小時後，使反應混合物於減壓下濃縮。將殘留物以乙醚稀釋，並過濾混合物。使所形成之濾液濃縮，而得 4.34 克標題化合物，為固體。此化合物具有足夠純度，以使用於後續反應中。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.29 (t, 3H), 4.27 (q, 2H), 4.97 (s, 1H), 6.55 (s, 1H).

¹⁹F NMR (CDCl₃) δ -63.4.

步驟 E： 5-氯基 -3-(三氟甲基)-1H-吡唑 -1-醋酸之製備

將 5-氯基 -3-(三氟甲基)-1H-吡唑 -1-醋酸乙酯(意即實例 10 步驟 D 或 D1 之產物)(218 毫克，0.85 毫莫耳)在四氫呋喃(1 毫升)中之溶液，以水(0.6 毫升)中之 50 重量%氫氧化鈉水溶液(0.2

毫升)處理。將反應混合物在室溫下攪拌4小時。將反應混合物以濃鹽酸水溶液處理，以降低pH至1，然後以醋酸乙酯萃取。使萃液脫水乾燥(MgSO₄)，及於壓力下濃縮，而得140毫克標題化合物。此化合物具有足夠純度，以使用於後續反應中。

¹H NMR (DMSO-d₆) δ 5.41 (s, 2H), 7.09 (s, 1H).

步驟F： 2-[5-氯基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮之製備

於4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶羧酸1,1-二甲基乙酯(意即實例1步驟A之產物)(1.026克，2.48毫莫耳)在乙醇(10毫升)中之溶液內，添加乙醚中之2M氯化氫溶液(4.2毫升，12.6毫莫耳)。將反應混合物在室溫下攪拌過夜。然後，將反應混合物在60°C下加熱2小時。使反應混合物冷卻至室溫，及在減壓下濃縮，而得0.710克4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶鹽酸鹽，為白色固體。

在室溫下，於二氯甲烷(5毫升)中之5-氯基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-醋酸(意即實例10步驟E之產物)(0.14克，0.61毫莫耳)內，添加N,N-二甲基甲醯胺(1滴)，接著為氯化草醯(0.07毫升，0.80毫莫耳)。將反應混合物在室溫下攪拌1小時，然後於減壓下濃縮。使所形成之粗製5-氯基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-氯化乙醯溶於5毫升二氯甲烷中，並在0°C下，將所形成之溶液逐滴添加至上述製成之4-[4-(4,5-二氫-5-

苯基-3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶鹽酸鹽(0.20克，0.57毫莫耳)與三乙胺(0.40毫升，2.85毫莫耳)在10毫升二氯甲烷中之混合物內。將反應混合物於室溫下攪拌過夜，然後以1.0N鹽酸水溶液稀釋。分離有機層，以水洗滌，脫水乾燥(MgSO₄)，及在減壓下濃縮，並藉由中壓液相層析法純化，使用己烷中之醋酸乙酯作為溶離劑，而得40毫克標題產物，為本發明化合物，為固體，於128-131°C下熔解。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.81 (m, 2H), 2.20 (m, 2H), 2.89 (m, 1H), 3.31 (m, 2H), 3.46 (m, 1H), 3.87 (m, 2H), 4.55 (m, 1H), 5.08 (m, 2H), 5.75 (m, 1H), 6.54 (s, 1H), 7.25-7.42 (m, 5H), 7.63 (s, 1H).

實例 11

2-[5-溴基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮(化合物126)之製備
步驟A： 5-溴-N,N-二甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-磺醯胺之製備

使N,N-二甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-磺醯胺(意即實例10步驟A之產物)(4.25克，17.5毫莫耳)在四氫呋喃(50毫升)中之經攪拌溶液冷卻至-78°C，然後，逐滴添加環己烷中之2M正-丁基鋰(10.0毫升，20.0毫莫耳)。將反應混合物再攪拌30分鐘，接著逐滴添加溴(1.0毫升，3.1克，18.7毫莫耳)。將反應混合物攪拌10分鐘，溫熱至室溫，並以鹽水(50毫升)使反應淬滅。將所形成之溶液以乙醚萃取，脫水乾燥(MgSO₄)，及在減壓下濃縮，而得6.77克標題化合物，為淡黃色油。此化合物具有足夠純度，以使用於後續反應中。

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.15 (s, 6H), 6.69 (s, 1H).

步驟 B： 5-溴基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶之製備

將 5-溴-N,N-二甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-磺醯胺 (意即實例 11 步驟 A 之產物) (4.50 克, 14.0 毫莫耳) 與三氟醋酸 (2.0 毫升, 26 毫莫耳) 之溶液於 25°C 下攪拌 4 小時。以水 (20 毫升) 稀釋反應混合物, 並添加氫氧化鈉, 以提升 pH 至 12。以氯仿萃取溶液, 脫水乾燥 (MgSO_4), 及在減壓下濃縮, 而得 2.73 克標題化合物, 為淡黃色油。此化合物具有足夠純度, 以使用於後續反應中。

^1H NMR (CDCl_3) δ 6.63 (m, 1H).

步驟 C： 5-溴基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-醋酸乙酯之製備

將 5-溴基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶 (意即實例 11 步驟 B 之產物) (2.73 克, 12.7 毫莫耳) 與碳酸鉀 (2.0 克, 14.5 毫莫耳) 在 N,N-二甲基甲醯胺 (20 毫升) 中之懸浮液, 以碘醋酸乙酯 (3.0 毫升, 25.3 毫莫耳) 處理, 並將所形成之混合物於 95°C 下攪拌 3 小時。將所形成之混合物以醋酸乙酯稀釋, 以水洗滌, 及脫水乾燥 (MgSO_4)。使反應混合物在真空中濃縮, 並藉由中壓液相層析法進一步純化, 使用己烷中之 0-50% 醋酸乙酯作為溶離劑, 而得 2.84 克標題化合物, 為褐色油。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.29 (m, 3H), 4.26 (q, 2H), 5.00 (m, 2H), 6.64 (s, 1H).

步驟 D： 5-溴基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-醋酸之製備

將 5-溴基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-醋酸乙酯 (意即實例 11 步驟 C 之產物) (2.84 克, 9.4 毫莫耳) 在四氫呋喃 (10 毫升) 中之溶液, 以 50 重量% 氫氧化鈉水溶液 (1.0 毫升) 處理。將反應混

合物於室溫下攪拌2小時。將反應混合物以濃鹽酸水溶液處理，以降低pH至1，然後以醋酸乙酯萃取。使萃液脫水乾燥(MgSO₄)，及在壓力下濃縮，而得2.26克標題化合物，為淡褐色固體。自1-氯基丁烷(20毫升)再結晶，獲得0.68克標題化合物，為有光澤淡粉紅色板狀物。

¹H NMR (CDCl₃) δ 5.08 (s, 2H), 6.65 (s, 1H).

步驟E： 2-[5-溴基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-[4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]乙酮之製備

於5-溴基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-醋酸(意即實例11步驟D之產物)(0.12克，0.61毫莫耳)在二氯甲烷(5毫升)中之溶液內，添加N,N-二甲基甲醯胺(1滴)，接著為氯化草醯(0.25毫升，2.86毫莫耳)。將反應混合物於室溫下攪拌1小時，然後在減壓下濃縮。使含有粗製氯化醯之殘留物溶於二氯甲烷(5毫升)中，並在0°C下，將溶液逐滴添加至4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1-六氫吡啶鹽酸鹽(意即實例10步驟F之中間產物)(0.15克，0.43毫莫耳)與三乙胺(0.25毫升，1.8毫莫耳)在二氯甲烷(5毫升)中之混合物內。使反應混合物溫熱至室溫，接著在室溫下攪拌過夜。然後，將混合物於1.0N鹽酸水溶液與二氯甲烷之間作分液處理。以水洗滌有機層，脫水乾燥(MgSO₄)，在減壓下濃縮，並藉由中壓液相層析法純化，使用己烷中之醋酸乙酯作為溶離劑，而得90毫克標題產物，為本發明化合物，為非晶質固體。

¹H NMR (CDCl₃) δ 1.84 (m, 2H), 2.20 (m, 2H), 2.89 (m, 1H), 3.31 (m,

2H), 3.46 (m, 1H), 3.89 (m, 2H), 4.58 (m, 1H), 5.11 (m, 2H), 5.75 (m, 1H), 6.63 (s, 1H), 7.25-7.42 (m, 5H), 7.66 (s, 1H).

實例 12

1-[4-[4-[(5R)-4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶
5 基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮(化合物3)之製備
步驟 A: 4,5-二氫-N,N-二甲基-5-苯基-3-異噁唑羧醯胺之製備

於氯化 2-(二甲胺基)-N-羥基-2-酮基乙醯亞胺(根據 E. Raleigh, 美國專利 3,557,089 之程序製成)(6.0 克, 40 毫莫耳)、
苯乙烯(6.0 克, 60 毫莫耳)在甲苯(15 毫升)中之溶液內, 添
10 加碳酸氫鉀(5.0 克, 50 毫莫耳)在水(25 毫升)中之溶液, 歷經
1 小時, 同時保持反應溫度在 7 與 10°C 之間。將反應混合
物以 10 毫升甲苯稀釋, 並再攪拌 10 分鐘。分離有機層, 且
以水洗滌。使有機層在減壓下濃縮, 直到沒有苯乙烯留下
為止, 而得 8.7 克標題化合物, 為淡黃色油。此化合物具有
15 足夠純度, 以使用於後續反應中。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 3.08 (s, 3H), 3.32 (s, 3H), 3.35 (dd, 1H), 3.71 (dd, 1H), 5.65 (dd, 1H), 7.35 (m, 5H).

步驟 B: 4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑羧酸之製備

於 4,5-二氫-N,N-二甲基-5-苯基-3-異噁唑羧醯胺(意即實例
20 12 步驟 A 之產物)(60.0 克, 275 毫莫耳)在甲醇(300 毫升)中之
溶液內, 逐滴添加氫氧化鈉水溶液(在 50 毫升水中之 44 克 50
重量% NaOH 水溶液), 歷經 30 分鐘, 同時保持反應混合物
之溫度於 45°C 下。使反應混合物冷卻至室溫, 並攪拌過夜。
在減壓下濃縮所形成之混合物, 及以 200 毫升水處理。使用

濃鹽酸將反應混合物之 pH 值調整至約 1.0。於醋酸乙酯 (200 毫升) 中萃取粗產物。使醋酸乙酯溶液在減壓下濃縮，並以己烷研製殘留物。過濾所形成之沉澱物，以己烷 (2 x 20 毫升) 洗滌，並在真空下乾燥，而得 46.5 克標題化合物，為固體。

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.25 (dd, 1H), 3.75 (dd, 1H), 5.85 (dd, 1H), 7.35 (m, 5H), 8.1 (br s, 1H).

步驟 C: (5R)-4,5-二氫 -5-苯基 -3-異噁唑 -羧酸之金雞寧鹽之製備

將外消旋 4,5-二氫 -5-苯基 -3-異噁唑 羧酸 (意即實例 12 步驟 B 之產物) (9.5 克，50 毫莫耳) 在甲醇 (70 毫升) 中之混合物加熱至 55°C，並添加金雞寧 (含有約 15% 二氫金雞寧，14.5 克，50 毫莫耳)，歷經 20 分鐘，同時保持反應混合物之溫度在 53 與 57°C 之間。使反應混合物冷卻至室溫，歷經 60 分鐘，然後逐滴添加水 (35 毫升)，歷經 30 分鐘。使所形成之漿液冷卻至 10°C，及過濾。將濾餅以 10 毫升水中之 25% 甲醇洗滌兩次，並風乾，而得 8.52 克標題化合物，為固體。產物之非對映異構比例係於 Daicel Chiralcel®, OD HPLC 管柱上，使用對掌性高性能液相層析法 (HPLC) 分析測定為約 99:1。

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.25 (dd, 1H), 3.75 (dd, 1H), 5.85 (dd, 1H), 7.35 (m, 5H), 8.1 (br s, 1H).

步驟 D: (5R)-4,5-二氫 -N,N-二甲基 -5-苯基 -3-異噁唑 -羧酸之金雞寧鹽之製備

將 (5R)-4,5-二氫 -5-苯基 -3-異噁唑 羧酸之金雞寧鹽 (意即實

例 12 步驟 C 之產物) (98% 非對映異構物過量, 16.5 克, 34.3 毫莫耳) 在 1N 鹽酸 (90 毫升)、環己烷 (100 毫升) 及醋酸乙酯 (40 毫升) 之混合物中配成漿液。在所有固體溶解後, 分離液相, 並將有機層以鹽水 (20 毫升) 洗滌, 及在減壓下濃縮, 而得 5.6 克白色固體。在室溫下, 於所形成之自由態酸 (5.0 克, 26.2 毫莫耳) 在醋酸乙酯 (100 毫升) 中之溶液內, 添加 N,N-二甲基甲醯胺 (1 滴), 接著為二氯化亞硫醯 (4.25 克, 35.7 毫莫耳)。然後, 將反應混合物於回流下加熱 3 小時。使所形成之混合物冷卻, 及在減壓下濃縮。使含有粗製氯化醯之殘留物溶於醋酸乙酯 (25 毫升) 中, 並將此溶液分次添加至二甲胺在四氫呋喃中之預冷卻 (5°C) 混合物 (29 毫升, 2.0M 溶液) 內, 同時保持混合物之溫度於 5-10°C 下。在添加完成時, 使反應混合物在減壓下濃縮, 並以水 (50 毫升) 稀釋。過濾所形成之沉澱物, 以水洗滌, 並抽氣乾燥過夜, 而得 4.1 克標題化合物, 為淡黃褐色固體, 於 59-61°C 下溶解。此化合物具有足夠純度, 以使用於後續反應中。

步驟 E: 2-溴基 -1-[(5R)-4,5-二氫 -5-苯基 -3-異噁唑基]乙酮之製備

使 (5R)-4,5-二氫 -N,N-二甲基 -5-苯基 -3-異噁唑 -羧醯胺 (意即實例 12 步驟 D 之產物) (3.5 克, 16.0 毫莫耳) 在四氫呋喃 (5 毫升) 與甲苯 (10 毫升) 之混合物中之溶液冷卻至 -15°C, 並於 -15°C 下, 添加溴化甲基鎂 (在四氫呋喃中之 3.0M 溶液, 8.8 毫升, 26.4 毫莫耳), 歷經 1 小時。然後, 將反應混合物傾倒於 20 克濃鹽酸與 80 克冰之混合物上, 並分離有機相。以醋

酸乙酯(100 毫升)萃取水相，並以鹽水(40 毫升)洗滌合併之萃液，及在減壓下濃縮，而得 3.2 克 1-[(5R)-4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基]乙酮。

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.55 (s, 3H), 3.17 (dd, 1H), 3.54 (dd, 1H), 5.75 (dd, 1H), 7.35 (m, 5H).

使 1-[(5R)-4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基]乙酮(3.2 克，16.7 毫莫耳)溶於 1,2-二氯乙烷(15 毫升)中，並添加溴(2.13 克，13.3 毫莫耳)在二氯乙烷(5 毫升)中之溶液，歷經 30 分鐘，同時保持反應混合物之溫度於約 30°C 下。將反應混合物以水(10 毫升)稀釋，並使有機層在減壓下濃縮，且藉由中壓液相層析法純化，使用己烷中之 35% 二氯甲烷作為溶離劑，而得 2.6 克標題化合物，為白色固體，於 $31\text{--}33^\circ\text{C}$ 下熔解。

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.20 (dd, 1H), 3.60 (dd, 1H), 4.49 (s, 2H), 5.80 (dd, 1H), 7.35 (m, 5H).

步驟 E1： 2-溴基-1-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基)-乙酮之替代製備

於 4,5-二氫-N,N-二甲基-5-苯基-3-異噁唑羧醯胺(意即實例 12 步驟 A 產物)(17 克，78.0 毫莫耳)在四氫呋喃(20 毫升)與甲苯(80 毫升)之混合物中之溶液內，添加溴化甲基鎂(在四氫呋喃中之 3.0M 溶液，28 毫升，84 毫莫耳)，歷經 1 小時，同時保持反應溫度在 -10 與 -15°C 之間。將反應混合物傾倒於濃鹽酸(20 克)與冰(80 克)之混合物上，並分離有機相。以醋酸乙酯(100 毫升)萃取水相，並以鹽水(40 毫升)洗滌合併之有機萃液，及在減壓下濃縮，而得 14.4 克 1-(4,5-二氫-5-苯基-3-

異噁唑基)乙酮，為淡黃色油。

^1H NMR (CDCl_3) δ 2.55 (s, 3H), 3.17 (dd, 1H), 3.54 (dd, 1H), 5.75 (dd, 1H), 7.35 (m, 5H).

使 1-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基)乙酮(11.5 克，60 毫莫耳)溶於醋酸乙酯(45 毫升)中，並添加溴(9.6 克，60.0 毫莫耳)在醋酸乙酯(30 毫升)中之溶液，歷經 30 分鐘，同時保持反應混合物之溫度在約 30°C 下。1 小時後，以水(10 毫升)稀釋反應混合物，並使有機層在減壓下濃縮，而得 16.7 克帶紅色油，其含有約 10% 起始甲基酮與 ~10% 二溴化酮。

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.20 (dd, 1H), 3.60 (dd, 1H), 4.49 (s, 2H), 5.80 (dd, 1H), 7.35 (m, 5H).

步驟 F： 1-[4-[4-[(5R)-4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-六氫吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮之製備

將 1-[2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基]-4-六氫吡啶-碳硫醯胺(意即實例 8 步驟 C 之產物)(1.7 克，5.0 毫莫耳)與 2-溴基-1-[(5R)-4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基]乙酮(意即實例 12 步驟 E 或 E1 之產物)(1.35 克，5 毫莫耳)在乙醇(15 毫升)中之混合物於 50°C 下加熱 30 分鐘。以水稀釋反應混合物，並以二氯甲烷萃取。將萃液以鹽水洗滌，脫水乾燥(MgSO_4)，及在減壓下濃縮，而得標題產物，為本發明化合物，為淡黃色膠質。高性能液相層析法(HPLC)分析顯示標題產物為約 95% 純，且含有呈約 98% 對掌異構物過量之(R)-對掌異構物。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.8 (m, 2H), 2.2 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.9 (m, 1H), 3.3 (m, 2H), 3.42 (dd, 1H), 3.82 (dd, 1H), 4.05 (m, 1H), 4.6 (m, 1H), 5.0 (q, 2H), 5.78 (dd, 1H), 6.35 (s, 1H), 7.4 (m, 5H), 7.62 (s, 1H).

實例 13

1-[4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異呔唑基)-2-噻唑基]-3,6-二氫-1(2H)-吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮

(化合物 217) 之製備

步驟 A: 4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異呔唑基)-2-噻唑基]吡啶之製備

在室溫下，於硫基異菸鹼醯胺(0.5 克，3.6 毫莫耳)在 1-甲基-2-四氫吡咯酮(25 毫升)中之溶液內，添加 2-氯基-1-(4,5-二氫-5-苯基-3-異呔唑基)乙酮(0.807 克，3.6 毫莫耳)。然後，將反應混合物加熱至 100°C ，歷經 3 小時。接著，使反應混合物冷卻至室溫，以水(100 毫升)使反應淬滅，以醋酸乙酯(50 毫升 x 2)萃取。將反應混合物以水(50 毫升)、鹽水(50 毫升)稀釋，並使有機層在減壓下濃縮，且藉由中壓液相層析法純化，使用氯仿中之 2% 甲醇作為溶離劑，而得 0.7 克標題化合物，為褐色固體。

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.5 (m, 1H), 3.9 (m, 1H), 5.8 (m, 1H), 7.35 (m, 5H), 8.16 (s, 1H), 8.3 (d, 2H), 8.8 (d, 2H).

步驟 B： 4-[4-(4,5-二氫 -5-苯基 -3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1,2,3,6-
四氫 -1-(苯基 甲基)吡啶之製備

於 4-[4-(4,5-二氫 -5-苯基 -3-異噁唑基)-2-噻唑基]吡啶 (0.60 克，
1.95 毫莫耳) 在甲苯 (10 毫升) 中之溶液內，添加溴化 (0.670
5 克， 3.90 毫莫耳)，並將反應混合物加熱至 100°C，歷經 12 小
時。然後，使反應混合物冷卻至室溫，過濾沉澱析出之固
體，並乾燥。使固體溶於甲醇 (10 毫升) 中，分次添加硼氫
化鈉 (0.072 克， 1.95 毫莫耳)。將反應混合物在室溫下攪拌 2
小時，以水 (50 毫升) 稀釋，以 1.5N 鹽酸水溶液中中和，及以醋
10 酸乙酯 (50 毫升) 萃取。以鹽水 (25 毫升) 稀釋反應混合物，並
使有機層在減壓下濃縮，且藉由中壓液相層析法純化，使
用氯仿中之 3% 甲醇作為溶離劑，而得 0.4 克標題化合物，為
白色固體。

^1H NMR (CDCl_3) δ 3.03-3.1 (m, 2H), 3.4-3.6 (m, 4H), 3.8-4.0 (m, 2H),
15 4.25-4.32 (m, 2H), 5.76-5.79 (m, 1H), 6.47 (s, 1H), 7.34-7.48 (m, 1OH),
7.72 (s, 1H).

步驟 C： 4-[4-(4,5-二氫 -5-苯基 -3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1,2,3,6-四
氫吡啶鹽酸鹽之製備

於 4-[4-(4,5-二氫 -5-苯基 -3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1,2,3,6-四氫
20 -1-(苯基 甲基)吡啶 (0.400 克， 0.99 毫莫耳) 在二氯乙烷 (10 毫升)
中之溶液內，添加氯甲酸 1-氯乙酯 (0.286 克， 1.99 毫莫耳)，
並將反應混合物加熱至 80°C，歷經 5 小時。使反應混合物冷
卻至室溫，及在減壓下濃縮。將甲醇 (10 毫升) 添加至殘留
物中，並將反應混合物加熱至 60°C，歷經 1 小時，冷卻至室

溫，及在減壓下濃縮。將殘留物以醋酸乙酯中之50%石油醚研製，並過濾所形成之固體，及乾燥，而得0.25克標題化合物，為白色固體。

^1H NMR (DMSO- d_6) δ 2.50-2.55 (m, 2H), 3.31-3.39 (m, 3H), 3.86-3.91 (m, 3H), 5.73-5.78 (m, 1H), 6.67 (s, 1H), 7.34-7.39 (m, 5H), 7.68 (s, 1H), 9.47 (s, 2H).

步驟D： 1-[4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基)-2-噻唑基]-3,6-二氫-1(2H)-吡啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基]乙酮之製備

在室溫下，於4-[4-(4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基)-2-噻唑基]-1,2,3,6-四氫吡啶鹽酸鹽(0.250克，0.720毫莫耳)與5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-醋酸(0.150克，0.720毫莫耳)在二氯甲烷(10毫升)中之溶液內，添加N-(3-二甲胺基丙基)-N'-乙基碳化二亞胺(0.138克，0.720毫莫耳)、1-羥基苯并三唑(0.024克，0.177毫莫耳)及三乙胺(0.145克，1.44毫莫耳)。將反應混合物在室溫下攪拌24小時。以二氯甲烷(30毫升)稀釋反應混合物，並以水(20毫升)與鹽水(20毫升)洗滌。分離有機層，以水洗滌，脫水乾燥(Na_2SO_4)，及在減壓下濃縮，並藉由中壓液相層析法純化，使用氯仿中之3%甲醇作為溶離劑，而得200毫克標題產物，為本發明化合物，為白色固體。

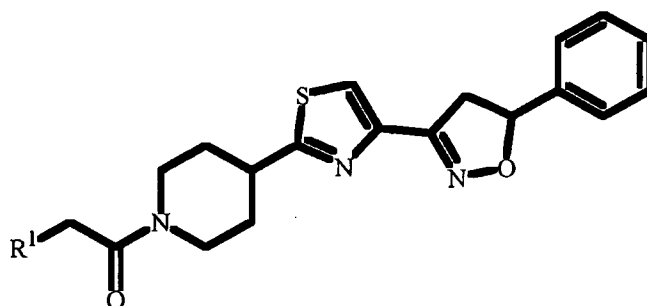
^1H NMR (CDCl_3) δ 2.3 (s, 3H), 2.71-2.75 (m, 2H), 3.42-3.46 (m, 1H), 3.74-3.88 (m, 3H), 4.24-4.27 (m, 2H), 5.02 (s, 2H), 5.71-5.76 (m, 1H), 6.32 (s, 1H), 6.57 (s, 1H), 7.3-7.38 (m, 5H), 7.64 (s, 1H).

藉由本文中所述之程序，以及此項技藝中已知之方法，

可製備下列表 1A 至 8 之化合物。下列縮寫係被使用於下文
表中：t 意謂第三，s 意謂第二，n 意謂常態，i 意謂異，c
意謂環，Ac 意謂乙醯基，Me 意謂甲基，Et 意謂乙基，Pr 意
謂丙基(意即正-丙基)，i-Pr 意謂異丙基，c-Pr 意謂環丙基，
5 Bu 意謂丁基，Pen 意謂戊基，Hex 意謂己基，Am 意謂戊基，
CN 意謂氰基。破折號(-)表示沒有任何取代基。

本發明包括但不限於下列舉例之物種。

表 1A



<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
苯基	3-乙基苯基
2-甲基苯基	3-丙基苯基
2-甲氧苯基	3-異丙基苯基
2-氯苯基	3-(三氟甲基)苯基
2-溴苯基	3-(2,2,2-三氟乙基)苯基
2-乙基苯基	3-(五氟乙基)苯基
2-乙氧苯基	3-氰基苯基
2-(甲硫基)苯基	3-硝基苯基
2-(乙硫基)苯基	2,5-二氯苯基
2-(三氟甲氧基)苯基	5-溴基-2-氯苯基
3-氯苯基	2-氯基-5-碘苯基
3-溴苯基	2-氯基-5-甲基苯基
3-碘苯基	2-氯基-5-乙基苯基

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
3-甲基苯基	2-氯基-5-丙基苯基
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	2-氯基-5-異丙基苯基
2-氯基-5-(2,2,2-三氟乙基)苯基	5-乙基-2-甲氧基苯基
2-氯基-5-(五氟乙基)苯基	2-甲氧基-5-丙基苯基
2-氯基-5-氰基苯基	5-異丙基-2-甲氧基苯基
2-氯基-5-硝基苯基	2-甲氧基-5-(三氟甲基)苯基
2-溴基-5-氯基苯基	2-甲氧基-5-(2,2,2-三氟乙基)苯基
2,5-二溴苯基	2-甲氧基-5-(五氟乙基)苯基
2-溴基-5-碘基苯基	5-氰基-2-甲氧基苯基
2-溴基-5-甲基苯基	2-甲氧基-5-硝基苯基
2-溴基-5-乙基苯基	5-氯基-2-乙基苯基
2-溴基-5-丙基苯基	5-溴基-2-乙基苯基
2-溴基-5-異丙基苯基	2-乙基-5-碘基苯基
2-溴基-5-(三氟甲基)苯基	2-乙基-5-甲基苯基
2-溴基-5-(2,2,2-三氟乙基)苯基	2,5-二乙基苯基
2-溴基-5-(五氟乙基)苯基	2-乙基-5-丙基苯基
2-溴基-5-氰基苯基	2-乙基-5-異丙基苯基
2-溴基-5-硝基苯基	2-乙基-5-(三氟甲基)苯基
5-氯基-2-甲基苯基	2-乙基-5-(2,2,2-三氟乙基)苯基
5-溴基-2-甲基苯基	2-乙基-5-(五氟乙基)苯基
5-碘基-2-甲基苯基	5-氰基-2-乙基苯基
2,5-二甲基苯基	2-乙基-5-硝基苯基
5-乙基-2-甲基苯基	3-甲基吡啶-1-基
2-甲基-5-丙基苯基	3-氯基吡啶-1-基
5-異丙基-2-甲基苯基	3-溴基吡啶-1-基
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	3-碘基吡啶-1-基
2-甲基-5-(2,2,2-三氟乙基)苯基	3-乙基吡啶-1-基
2-甲基-5-(五氟乙基)苯基	3-(三氟甲基)吡啶-1-基

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-氰基-2-甲基苯基	3-(2,2,2-三氟乙基)吡啶-1-基
2-甲基-5-硝基苯基	3-(五氟乙基)吡啶-1-基
5-氯基-2-甲氧苯基	3-氰基吡啶-1-基
5-溴基-2-甲氧苯基	3-硝基吡啶-1-基
5-碘基-2-甲氧苯基	3,5-二甲基吡啶-1-基
2-甲氧基-5-甲基苯基	3-氯基-5-甲基吡啶-1-基
3-碘基-5-甲基吡啶-1-基	3-溴基-5-甲基吡啶-1-基
3-乙基-5-甲基吡啶-1-基	5-甲氧基-3-甲基吡啶-1-基
5-甲基-3-丙基吡啶-1-基	3-氯基-5-甲氧基吡啶-1-基
3-異丙基-5-甲基吡啶-1-基	5-乙基-3-甲基吡啶-1-基
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	3-氯基-5-乙基吡啶-1-基
5-甲基-3-(2,2,2-三氟乙基)吡啶-1-基	3-溴基-5-乙基吡啶-1-基
5-甲基-3-(五氟乙基)吡啶-1-基	5-乙基-3-碘基吡啶-1-基
3-氰基-5-甲基吡啶-1-基	3,5-二乙基吡啶-1-基
5-甲基-3-硝基吡啶-1-基	5-乙基-3-丙基吡啶-1-基
5-氯基-3-甲基吡啶-1-基	5-乙基-3-異丙基吡啶-1-基
3,5-二氯吡啶-1-基	5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基
5-氯基-3-溴基吡啶-1-基	5-乙基-3-(2,2,2-三氟乙基)吡啶-1-基
5-氯基-3-碘基吡啶-1-基	5-乙基-3-(五氟乙基)吡啶-1-基
5-氯基-3-乙基吡啶-1-基	3-氰基-5-乙基吡啶-1-基
5-氯基-3-丙基吡啶-1-基	5-乙基-3-硝基吡啶-1-基
5-氯基-3-異丙基吡啶-1-基	5-丁基-2-甲基苯基
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	5-己基-2-甲基苯基
5-氯基-3-(2,2,2-三氟乙基)吡啶-1-基	5-烯丙基-2-甲基苯基
5-氯基-3-(五氟乙基)吡啶-1-基	2-甲基-5-(4-甲基-3-戊烯基)苯基
5-氯基-3-氰基吡啶-1-基	2-甲基-5-炔丙基苯基

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-氯基-3-硝基吡唑-1-基	2-甲基-5-(3-甲基炔丙基)苯基
5-溴基-3-甲基吡唑-1-基	5-環丙基-2-甲基苯基
5-溴基-3-氯基吡唑-1-基	5-環己基-2-甲基苯基
3,5-二溴基吡唑-1-基	2-甲基-5-(五氟基異丙基)苯基
5-溴基-3-碘基吡唑-1-基	5-(3,3-二氯-2-丙烯-1-基)-2-甲基 苯基
5-溴基-3-乙基吡唑-1-基	2-甲基-5-(4,4,4-三氟-2-丁炔-1- 基)苯基
5-溴基-3-丙基吡唑-1-基	5-(2,2-二氯環丙-1-基)-2-甲基苯基
5-溴基-3-異丙基吡唑-1-基	2-甲基-5-(三氟甲氧基)苯基
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	2-氯基-5-(異丁基硫基)苯基
5-溴基-3-(2,2,2-三氟乙基)吡唑 -1-基	2-氯基-5-(乙基磺醯基)苯基
5-溴基-3-(五氟乙基)吡唑-1-基	2-氯基-5-(三氟甲基硫基)苯基
5-溴基-3-氰基吡唑-1-基	2-氯基-5-(三氟甲基磺醯基)苯基
5-溴基-3-硝基吡唑-1-基	2-氯基-5-(甲胺基)苯基
2-氯基-5-(二甲胺基)苯基	2-氯基-5-(第三-丁基胺基)苯基
2-氯基-5-(二乙胺基)苯基	2,5-二甲基-3-呋喃基
2-氯基-5-(環丙胺基)苯基	2,5-二甲基-3-噻吩基
3-(甲氧基甲基)苯基	2,5-二氯-3-噻吩基
2-氯基-5-(乙氧基甲基)苯基	1,4-二甲基-3-吡咯基
2-氯基-5-(羥甲基)苯基	1,4-二甲基-3-吡唑基
2-氯基-5-(甲氧羰基)苯基	1,3-二甲基-4-吡唑基
2-氯基-5-(乙基羰基)苯基	2,5-二甲基-4-噁唑基
2-氯基-5-(甲基羰基氧基)苯基	2,5-二甲基-4-噻唑基
2-氯基-5-(甲胺基羰基)苯基	3-溴基-4-異噻唑基
2-氯基-5-(二甲胺基羰基)苯基	3-溴基-4-異噁唑基
2-甲基-5-(三甲基矽烷基)苯基	1-甲基-4-咪唑基
3,5-二甲基-2-噻吩基	5-(三氟甲基)-3-(1,2,4-噁二唑基)

R¹
3,5-二氯-2-噻吩基
3,5-二甲基-2-呋喃基
1-甲基-2-吡咯基
4-甲基-2-(三氟甲基)-5-噻唑基
4-(三氟甲基)-2-噻唑基
4-O-2-噻唑基
4-甲基-2-(三氟甲基)-5-噻唑基
4-溴基-5-異噻唑基
4-溴基-5-異噻唑基
1-甲基-5-吡唑基
1-甲基-5-咪唑基
1-甲基-4-(三氟甲基)-2-咪唑基
4-甲基-3-(1,3,4-三唑基)
2-甲基-3-(1,2,4-三唑基)
5-(三氟甲基)-2-(1,3,4-噻二唑基)
5-(三氟甲基)-2-(1,3,4-噻二唑基)
3-(三氟甲基)-5-(1,2,4-噻二唑基)
3-(三氟甲基)-5-(1,2,4-噻二唑基)
3-(三氟甲基)-1-(1,2,4-三唑基)
2,5-二甲基-1-吡咯基
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基
3-溴基-5-(三氟甲基)吡唑-1-基
3-碘基-5-(三氟甲基)吡唑-1-基
3-乙基-5-(三氟甲基)-吡唑-1-基
3-丙基-5-(三氟甲基)吡唑-1-基
3-異丙基-5-(三氟甲基)吡唑-1-基
3-甲基-5-(三氟甲基)-吡唑-1-基

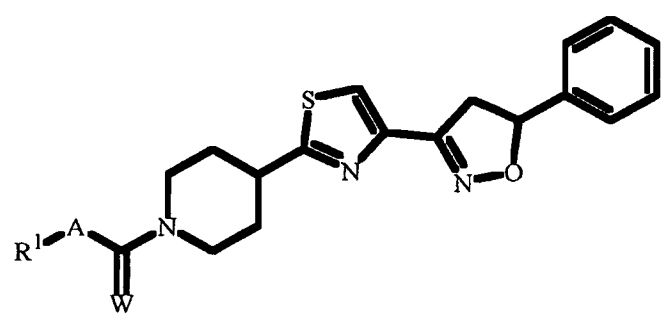
R¹
5-(三氟甲基)-3-(1,2,4-噻二唑基)
2-溴基-1-(1,3,4-三唑基)
5-(三氟甲基)-3-(1,2,4-三唑基)
2-溴基-1-咪唑基
3,6-二甲基-2-吡啶基
2,5-二甲基-3-吡啶基
2,5-二甲基-4-吡啶基
3,6-二氯-2-吡啶基
2,5-二氯-3-吡啶基
2,5-二氯-4-吡啶基
4-溴基-3-嗒吡基
4-(三氟甲基)-2-嘧啶基
3,6-二甲基-2-吡吡基
2,5-二甲基-4-嘧啶基
4-甲氧基-5-嘧啶基
3,6-二甲基-4-嗒吡基
5-(三氟甲基)-3-(1,2,4-三吡基)
5-甲氧基-6-(1,2,4-三吡基)
4-(三氟甲基)-2-(1,3,5-三吡基)
3,6-二甲基-5-(1,2,4-三吡基)
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基
3-(2,2,2-三氟乙基)-5-(三氟甲
基)吡唑-1-基
3-(五氟乙基)-5-(三氟甲基)吡
唑-1-基
3-氟基-5-(三氟甲基)吡唑-1-基
3-硝基-5-(三氟甲基)吡唑-1-基
3-氯基-5-(三氟甲基)-吡唑-1-基



<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
3-甲氧基-5-(三氟甲基)-吡唑-1-基	3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基
5-二氟甲氧基-3-甲基吡唑-1-基	3-二氟甲氧基-5-甲基吡唑-1-基
5-二氟甲氧基-3-氯基吡唑-1-基	3-二氟甲氧基-5-氯基吡唑-1-基
3,5-二溴基吡唑-1-基	3-二氟甲氧基-5-溴基吡唑-1-基
5-二氟甲氧基-3-碘基吡唑-1-基	3-二氟甲氧基-5-碘基吡唑-1-基
5-二氟甲氧基-3-乙基吡唑-1-基	3-二氟甲氧基-5-乙基吡唑-1-基
5-二氟甲氧基-3-丙基吡唑-1-基	3-二氟甲氧基-5-(三氟甲基)吡唑-1-基
5-二氟甲氧基-3-異丙基吡唑-1-基	3-二氟甲氧基-5-(2,2,2-三氟乙基)吡唑-1-基
5-二氟甲氧基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	3-二氟甲氧基-5-(五氟乙基)吡唑-1-基
5-二氟甲氧基-3-(2,2,2-三氟乙基)吡唑-1-基	3-二氟甲氧基-5-氰基吡唑-1-基
5-二氟甲氧基-3-(五氟乙基)吡唑-1-基	3-二氟甲氧基-5-硝基吡唑-1-基
5-二氟甲氧基-3-氰基吡唑-1-基	3,5-雙-(二氟甲氧基)吡唑-1-基
5-二氟甲氧基-3-硝基吡唑-1-基	5-甲氧羰基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基
3-甲氧羰基-5-(三氟甲基)吡唑-1-基	3,5-二甲氧基吡唑-1-基
5-甲氧基-3-甲基吡唑-1-基	5-乙氧基-3-甲基吡唑-1-基
5-甲氧基-3-溴基吡唑-1-基	5-乙氧基-3-溴基吡唑-1-基
5-甲氧基-3-碘基吡唑-1-基	5-乙氧基-3-碘基吡唑-1-基
5-甲氧基-3-乙基吡唑-1-基	5-乙氧基-3-乙基吡唑-1-基
5-甲氧基-3-丙基吡唑-1-基	5-乙氧基-3-丙基吡唑-1-基
5-甲氧基-3-異丙基吡唑-1-基	5-乙氧基-3-異丙基吡唑-1-基
5-甲氧基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	5-乙氧基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基

<u>R¹</u>	<u>R¹</u>
5-甲氧基-3-(2,2,2-三氟乙基)吡唑-1-基	5-乙氧基-3-(2,2,2-三氟乙基)吡唑-1-基
5-甲氧基-3-(五氟乙基)吡唑-1-基	5-乙氧基-3-(五氟乙基)吡唑-1-基
5-甲氧基-3-氰基吡唑-1-基	5-乙氧基-3-氰基吡唑-1-基
5-甲氧基-3-硝基吡唑-1-基	5-乙氧基-3-硝基吡唑-1-基

表 1B

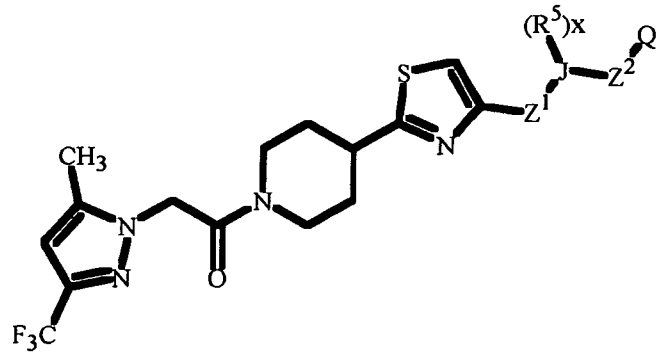


<u>R¹</u>	<u>A</u>	<u>W</u>
2-甲氧苯基	NH	O
2,5-二氯苯基	NH	O
5-溴基-2-氯苯基	NH	O
2-氯基-5-甲基苯基	NH	O
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	NH	O
2,5-二溴苯基	NH	O
2-溴基-5-甲基苯基	NH	O
2-溴基-5-(三氟甲基)苯基	NH	O
5-氯基-2-甲基苯基	NH	O
5-溴基-2-甲基苯基	NH	O
2,5-二甲基苯基	NH	O
5-乙基-2-甲基苯基	NH	O
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	NH	O
5-溴基-2-甲氧苯基	NH	O
2-甲氧基-5-甲基苯基	NH	O

<u>R¹</u>	<u>A</u>	<u>W</u>
2-甲氧基-5-(三氟甲基)苯基	NH	O
3-乙基-5-甲基吡啶-1-基	CH ₂	S
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	CH ₂	S
3,5-二氯吡啶-1-基	CH ₂	S
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	CH ₂	S
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	CH ₂	S
3,5-二甲基吡啶-1-基	CH ₂	S
3,5-二溴基吡啶-1-基	CH ₂	S
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	CH ₂	S
3,5-二乙基吡啶-1-基	CH ₂	S
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	CH ₂	S
2-甲氧苯基	NH	S
2,5-二氯苯基	NH	S
5-溴基-2-氯苯基	NH	S
2-氯基-5-甲基苯基	NH	S
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	NH	S
2,5-二溴苯基	NH	S
2-溴基-5-甲基苯基	NH	S
2-溴基-5-(三氟甲基)苯基	NH	S
5-氯基-2-甲基苯基	NH	S
5-溴基-2-甲基苯基	NH	S
2,5-二甲基苯基	NH	S
5-乙基-2-甲基苯基	NH	S
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	NH	S
5-溴基-2-甲氧苯基	NH	S
2-甲氧基-5-甲基苯基	NH	S
2-甲氧基-5-(三氟甲基)苯基	NH	S
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	NCH ₃	O

<u>R¹</u>	<u>A</u>	<u>W</u>
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	NAc	O
3-甲基-5-(三氟甲基)吡唑-1-基	CH ₂	O
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	CHCH ₃	O
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	CHCOOCH ₃	O
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	CHCl	O
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	NCOOCH ₃	O
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	NH	S
3,5-二甲基吡唑-1-基	NH	O
3,5-二氯吡唑-1-基	NH	O
3,5-二溴基吡唑-1-基	NH	O
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	NH	O
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	NH	O
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	NH	O
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	NH	O
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	NH	O
3-甲基-5-(三氟甲基)吡唑-1-基	NH	O
3-氯基-5-(三氟甲基)吡唑-1-基	NH	O
3-溴基-5-(三氟甲基)吡唑-1-基	NH	O
5-甲氧基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	NH	O
5-二氟甲氧基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	NH	O

表 2*



<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-1	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-1	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-1	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-1	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-2	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-2	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-2	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-2	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-3	1-Me	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-3	1-Me	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-3	1-Me	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-3	1-Me	鍵結	Q-45	-	-	5/2
CH ₂	J-3	-	鍵結	Q-45	-	-	1/4
鍵結	J-3	-	鍵結	Q-45	-	-	4/1
鍵結	J-4	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-4	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-4	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-4	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-4	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-4	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-5	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-5	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-5	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-5	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-5	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-5	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-6	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-6	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-6	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-6	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-6	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-6	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3

<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
CH ₂	J-6	-	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-6	-	鍵結	Q-45	-	-	3/1
鍵結	J-7	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-7	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-8	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-8	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-9	1-Me	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-9	1-Me	鍵結	Q-45	-	-	3/5
CH ₂	J-9	-	鍵結	Q-45	-	-	1/4
鍵結	J-9	-	鍵結	Q-45	-	-	4/1
鍵結	J-10	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-10	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-11	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-11	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-12	1-Me	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-12	1-Me	鍵結	Q-45	-	-	5/3
CH ₂	J-12	-	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-12	-	鍵結	Q-45	-	-	3/1
鍵結	J-13	-	鍵結	Q-45	-	-	1/4
鍵結	J-13	-	鍵結	Q-45	-	-	4/1
鍵結	J-14	1-Me	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-14	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-15	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-16	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
CH ₂	J-17	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-17	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
CH ₂	J-18	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-18	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-19	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-19	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-20	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-20	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5

$\underline{Z}^1$	$\underline{J}$	$(R^5)_x$	$\underline{Z}^2$	$\underline{Q}$	$(R^7)_p$	R^{12}	$\underline{J}$ -取向**
鍵結	J-20	-	鍵結	Q-45	-	-	2/6
鍵結	J-20	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-20	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-20	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-21	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-21	-	鍵結	Q-45	-	-	3/6
鍵結	J-21	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-22	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-22	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-22	-	鍵結	Q-45	-	-	4/6
鍵結	J-22	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-22	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-23	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-23	-	鍵結	Q-45	-	-	2/6
鍵結	J-24	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-24	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-24	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-24	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-25	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-25	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-25	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-25	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-26	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-26	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-26	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-26	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
CH ₂	J-26	-	鍵結	Q-45	-	-	1/4
鍵結	J-26	-	鍵結	Q-45	-	-	4/1
鍵結	J-27	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-27	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-27	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-27	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2

<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-27	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-27	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-28	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-28	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-30	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-30	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
CH ₂	J-30	-	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-30	-	鍵結	Q-45	-	-	3/1
CH ₂	J-30	-	鍵結	Q-45	-	-	1/4
鍵結	J-30	-	鍵結	Q-45	-	-	4/1
CH ₂	J-31	-	鍵結	Q-45	-	-	1/3
CH ₂	J-31	-	鍵結	Q-45	-	-	1/4
鍵結	J-31	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-31	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-31	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-31	-	鍵結	Q-45	-	-	3/1
鍵結	J-31	-	鍵結	Q-45	-	-	4/1
鍵結	J-31	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-31	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-32	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-32	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-32	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-32	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-32	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-32	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-33	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-33	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-33	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-33	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-33	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2



<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-33	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-34	-	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-34	-	鍵結	Q-45	-	-	1/4
鍵結	J-34	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-34	-	鍵結	Q-45	-	-	3/1
鍵結	J-34	-	鍵結	Q-45	-	-	4/1
CH ₂	J-35	-	鍵結	Q-45	-	-	1/4
鍵結	J-35	-	鍵結	Q-45	-	-	4/1
CH ₂	J-36	-	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-36	-	鍵結	Q-45	-	-	3/1
鍵結	J-36	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-36	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-37	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-37	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-37	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-37	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-38	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-38	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-38	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-38	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-39	4-Me	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-39	4-Me	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-40	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-40	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-41	-	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-41	-	鍵結	Q-45	-	-	1/4
CH ₂	J-42	-	鍵結	Q-45	-	-	1/3
CH ₂	J-42	-	鍵結	Q-45	-	-	1/4
CH ₂	J-43	-	鍵結	Q-45	-	-	1/4
鍵結	J-44	-	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-44	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-44	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5

<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-44	-	鍵結	Q-45	-	-	2/6
鍵結	J-45	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-45	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-45	-	鍵結	Q-45	-	-	2/6
鍵結	J-46	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-46	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-46	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-46	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-47	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-47	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-47	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-47	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-48	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-49	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-49	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-49	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-49	-	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-50	-	鍵結	Q-45	-	-	2/6
鍵結	J-51	-	鍵結	Q-45	-	-	2/6
鍵結	J-52	-	鍵結	Q-45	-	-	2/6
鍵結	J-53	-	-	-	-	-	2/3
鍵結	J-54	-	-	-	-	-	2/3
鍵結	J-55	-	-	-	-	-	2/3
鍵結	J-56	-	-	-	-	-	2/3
鍵結	J-57	1-Me	-	-	-	-	2/4
鍵結	J-58	1-Me	-	-	-	-	3/4
鍵結	J-59	-	-	-	-	-	2/4
鍵結	J-60	-	-	-	-	-	2/4
鍵結	J-61	-	-	-	-	-	2/4
鍵結	J-62	-	-	-	-	-	2/4
鍵結	J-63	-	-	-	-	-	3/4
鍵結	J-64	-	-	-	-	-	2/3

<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-65	-	-	-	-	-	3/4
鍵結	J-66	-	-	-	-	-	6/7
鍵結	J-67	-	-	-	-	-	2/3
鍵結	J-68	-	-	-	-	-	2/3
鍵結	J-69	-	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	-	鍵結	Q-45	-	-	1/4
鍵結	J-70	-	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-71	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-71	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-72	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-72	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-73	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-73	-	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-73	-	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-73	-	鍵結	Q-45	-	-	1/4
鍵結	J-73	-	鍵結	Q-45	-	-	4/1
鍵結	J-74	3-Me	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-74	3-Me	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-74	3-Me	鍵結	Q-45	-	-	4/2
鍵結	J-74	3-Me	鍵結	Q-45	-	-	5/2
鍵結	J-74	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-74	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-75	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-75	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-75	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-75	-	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-75	2-Me	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-75	2-Me	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-76	-	鍵結	Q-45	-	-	3/6
鍵結	J-76	-	鍵結	Q-45	-	-	6/3
鍵結	J-77	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-77	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3

<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-78	-	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-79	-	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-79	-	鍵結	Q-45	-	-	3/1
鍵結	J-80	-	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-80	-	鍵結	Q-45	-	-	3/1
鍵結	J-81	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-81	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-82	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-82	-	鍵結	Q-45	-	-	3/6
鍵結	J-82	-	鍵結	Q-45	-	-	5/3
鍵結	J-82	-	鍵結	Q-45	-	-	6/3
CH ₂	J-83	-	-	-	-	-	2/6
O	J-29	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
S	J-29	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
SO	J-29	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
SO ₂	J-29	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
NH	J-29	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
NMe	J-29	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
NPr	J-29	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
CH ₂	J-29	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
CH-i-Bu	J-29	-	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	4-Me	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-Me	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	4,5-二-Me	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	4,4-二-Me	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	[註1]	鍵結	Q-45	6-Me, [註1]	-	3/5
鍵結	J-29	[註2]	鍵結	Q-45	6-Me, [註2]	-	3/5
鍵結	J-29	5-Et	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-t-Bu	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-第三-戊基	-	-	-	-	3/5

<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-29	5-(4-Me-3-戊烯-1-基)	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-(3,3-二-Me-1-丁炔-1-基)	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-c-Pr	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-(4-Me-環己基)	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-CF ₃	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-全氟丙基	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-(3,3-二-C1-2-丙烯-1-基)	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-OMe	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-SiMe ₃	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-69	4-F	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-Cl	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-OH	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-NH ₂	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-CN	O	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-NO ₂	NH	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-CF ₃	S	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	-	O	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	-	S	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	-	SO	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	-	SO ₂	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	-	NH	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	-	N-Me	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	-	CH ₂	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-OEt	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-OCF ₃	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-SMe	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-SOMe	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-SO ₂ Me	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-SO ₂ -t-Bu	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-SCF ₃	鍵結	Q-45	-	-	1/3

<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-69	4-SO ₂ CH ₂ CF ₃	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-22	4-NH-i-Bu	-	-	-	-	2/4
鍵結	J-22	4-二-EtN	-	-	-	-	2/4
鍵結	J-22	4-NH-環己基	-	-	-	-	2/4
鍵結	J-69	4-CH ₂ O-i-Pr	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-CH ₂ OCHF ₂	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-CH ₂ OH	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-74	3-乙醯基	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-69	4-CO ₂ -i-Pr	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-O-乙醯基	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-S-乙醯基	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-CONHMe	鍵結	Q-45	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-CONEt ₂	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	-	O	Q-45	-	-	1/4
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-1	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-2	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-3	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-4	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-5	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-6	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-7	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-8	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-9	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-10	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-11	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-12	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-13	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-14	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-15	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-16	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-17	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-18	-	-	3/5

<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-19	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-20	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-21	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-22	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-23	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-24	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-25	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-26	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-27	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-28	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-29	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-30	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-31	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-32	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-33	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-34	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-35	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-36	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-37	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-38	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-39	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-40	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-41	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-42	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-43	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-44	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-46	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	CH ₂	Q-47	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-48	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-49	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-50	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-51	-	-	3/5

<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-52	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-53	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-54	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-55	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-56	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-57	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-58	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-59	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-60	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-61	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-62	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-63	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-64	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-65	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-66	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-67	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-68	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-69	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	2-Me	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	3-Me	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	4-Me	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	2-Cl	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	3-Cl	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	4-Cl	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	2-OMe	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	3-OMe	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	4-OMe	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	2-Et	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	3-i-Pr	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	2,6-二-Me	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	4-乙烯基	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	4-乙炔基	-	3/5

Z^1	J	$(R^5)_x$	Z^2	Q	$(R^7)_p$	R^{12}	J-取向**
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	4-c-Pr	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	3-CF ₃	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	3-OCF ₃	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	4-Br	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	3-OH	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	3-NH ₂	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	2-CN	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	2-NO ₂	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	4-O-t-Bu	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	4-SMe	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	4-SCF ₃	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	3-SO ₂ Me	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	3-NHMe	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	4-NMe ₂	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	2-CH ₂ OMe	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	3-COMe	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	3-CO ₂ Me	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	3-CONHMe	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	4-OCOMe	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	4-SCOMe	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	3-CONMe ₂	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	4-SiMe ₃	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	2,6-二-F	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	2,6-二-Cl	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	2-OH	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-45	4-OCHF ₂	-	3/5
鍵結	J-26	1-Me	鍵結	Q-45	-	-	2/5
鍵結	J-26	[註3]	鍵結	Q-45	[註3]	-	2/5
鍵結	J-26	1-Me, [註3]	鍵結	Q-45	[註3]	-	2/5
鍵結	J-26	-	鍵結	Q-45	4-OH	-	2/5
鍵結	J-26	-	鍵結	Q-45	4-OMe	-	2/5
鍵結	J-26	-	CH ₂	Q-45	4-OH	-	2/5

<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-26	-	CH ₂	Q-45	4-OMe	-	2/5
鍵結	J-26	-	鍵結	Q-45	4-OH	-	2/4
鍵結	J-26	-	鍵結	Q-45	4-OMe	-	2/4
鍵結	J-26	-	CH ₂	Q-45	4-OH	-	2/4
鍵結	J-26	-	CH ₂	Q-45	4-OMe	-	2/4
鍵結	J-25	-	鍵結	Q-45	4-OH	-	2/4
鍵結	J-25	-	鍵結	Q-45	4-OMe	-	2/4
鍵結	J-25	-	CH ₂	Q-45	4-OH	-	2/4
鍵結	J-25	-	CH ₂	Q-45	4-OMe	-	2/4
鍵結	J-1	5-Me	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-3	-	鍵結	Q-45	-	-	2/4
鍵結	J-3	[註4]	鍵結	Q-45	[註4]	-	2/5
鍵結	J-29	5-CO ₂ Me	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-CO ₂ Et	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	4,4-二-Me-5-CO ₂ Me	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-CONEt ₂	鍵結	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	NH	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	NMe	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	NEt	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	NPr	Q-45	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-NHAc	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-NAc ₂	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-N(Me)Ac	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-N(Me)C(=O)Ph	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-N(Et)Ac	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-N(Et)C(=O)Ph	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-NHC(=O)OMe	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-N(Me)C(=O)OMe	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-NHC(=O)OEt	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5-N(Me)C(=O)OEt	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-69	3-Cl	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-Br	-	-	-	-	1/3

<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-69	3-I	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-Me	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-Et	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-Pr	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-i-Pr	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-Bu	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-i-Bu	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-s-Bu	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-t-Bu	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-Am	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-i-Am	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-t-Am	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-環丙基	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-環丁基	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-環戊基	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-環己基	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-三氟甲氧基	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-異丙氧基	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	3-異丁氧基	-	-	-	-	1/3
鍵結	J-69	4-Cl	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-Br	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-I	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-Me	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-Et	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-Pr	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-i-Pr	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-Bu	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-i-Bu	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-s-Bu	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-t-Bu	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-Am	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-i-Am	-	-	-	-	1/4

<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-69	4-t-Am	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-環丙基	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-環丁基	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-環戊基	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-環己基	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-三氟甲氧基	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-異丙氧基	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	4-異丁氧基	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	3,4-二-Cl	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	3,4-二-Br	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	3,4-二-Me	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	3,4-二-Et	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	3,4-二-OMe	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	3,4-二-OEt	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-69	3-OMe-4-O-炔丙基	-	-	-	-	1/4
鍵結	J-4	5-i-Bu	-	-	-	-	2/5
鍵結	J-4	5-i-Am	-	-	-	-	2/5
鍵結	J-5	5-i-Bu	-	-	-	-	2/5
鍵結	J-5	5-i-Am	-	-	-	-	2/5
鍵結	J-11	5-i-Bu	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-11	5-i-Am	-	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-70	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-72	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-73	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-74	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-75	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-76	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-77	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-78	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-79	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-80	-	-	3/5

<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-81	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-82	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-83	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-84	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-85	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-86	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-87	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-88	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-89	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-90	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-91	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-92	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-93	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-94	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-95	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-96	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-97	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-98	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-99	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-100	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-101	-	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-102	-	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-87	4-苯基	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-72	-	乙醯基	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-72	-	甲氧羰基	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-72	-	甲氧基	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	4-Cl	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	5-Cl	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	6-Cl	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	7-Cl	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	4-Me	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	5-Me	-	3/5

<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	6-Me	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	5-CF ₃	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	5-NO ₂	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	6-Br	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	6-NO ₂	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	6-NH ₂	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	6-OMe	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	5,6-二-OMe	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-71	5,6-二-Cl	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-70	5-Cl	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-70	5-Me	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-70	5-NO ₂	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-70	5-NH ₂	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-70	6-Cl	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-70	6-Me	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-70	6-NO ₂	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-70	6-NH ₂	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-70	5,6-二-Cl	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-70	5-Cl-6-OH	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-72	5-Cl	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-72	5-Me	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-72	5-NO ₂	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-72	5-NH ₂	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-72	6-Cl	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-72	6-Me	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-72	6-NO ₂	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-72	6-NH ₂	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-72	5,6-二-Cl	Me	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-63	4-Me	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-63	4-NO ₂	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-63	4-NH ₂	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-63	5-Cl	-	3/5

<u>Z¹</u>	<u>J</u>	<u>(R⁵)_x</u>	<u>Z²</u>	<u>Q</u>	<u>(R⁷)_p</u>	<u>R¹²</u>	<u>J-取向**</u>
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-63	5-Me	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-63	5-CN	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-63	5-NO ₂	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-63	5-NH ₂	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-63	5-COOMe	-	3/5
鍵結	J-29	-	鍵結	Q-63	5,6-二-Cl	-	3/5
鍵結	J-29	5-N(Ac)C(=O)Ph	鍵結	-	-	-	3/5
鍵結	J-29	5N(Ac)C(=O) (2-甲氧羰基-Ph)	鍵結	-	-	-	3/5

* J, R⁵, Q, R⁷及 R¹²在此表之化合物中之定義，均如上文具體實施例中展示表3與4中之定義。在(R⁵)_x欄中之破折號 "-" 表示在J上沒有取代。於各Z²與Q欄中之破折號表示沒有Z²Q取代基作為R⁵連接至J。在(R⁷)_p及 / 或 R¹²欄中之破折號表示在Q上沒有取代。

** J-取向係指對環J上Z¹與Z²(或當Z²不存在時，為另一個R⁵)之連接點。第一個數目係指在J上Z¹被連接之環位置，而第二個數目係指在J上Z²被連接之環位置，或當Z²不存在時，為在J上，於(R⁵)_x下所列示取代基被連接之環位置。

[註1]: R⁵與R⁷一起採用以形成在J-29之位置4與Q-45之位置2間之CH₂CH₂橋基。

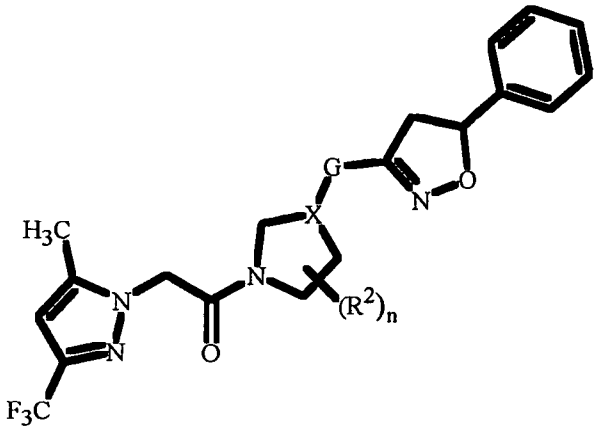
[註2]: R⁵與R⁷一起採用以形成在J-29之位置4與Q-45之位置2間之CH₂橋基。

[註3]: R⁵與R⁷一起採用以形成在J-26之位置4與Q-45之位置2間之CH₂CH₂橋基。

[註4]: R⁵與R⁷一起採用以形成在J-3之位置1與Q-45之位

置 2 間之 CH₂CH₂ 橋基。

表 3



<u>X</u>	<u>(R²)_n</u>	<u>G</u>	<u>R^{3a}</u>	<u>R^{11a}</u>
X ¹	-	G-1	H	-
X ¹	-	G-2	H	-
X ¹	-	G-3	H	H
X ¹	-	G-4	H	-
X ¹	-	G-5	H	-
X ¹	-	G-6	H	H
X ¹	-	G-7	H	-
X ¹	-	G-8	H	-
X ¹	-	G-9	H	H
X ¹	-	G-10	H	-
X ¹	-	G-11	H	-
X ¹	-	G-12	H	H
X ¹	-	G-13	H	H
X ¹	-	G-14	H	-
X ¹	-	G-15	H	-
X ¹	-	G-16	H	H
X ¹	-	G-17	H	-
X ¹	-	G-18	H	-
X ¹	-	G-19	H	H
X ¹	-	G-20	H	-
X ¹	-	G-21	H	-
X ¹	-	G-22	H	H
X ¹	-	G-23	H	-

<u>X</u>	<u>(R²)_n</u>	<u>G</u>	<u>R^{3a}</u>	<u>R^{11a}</u>
X ¹	-	G-24	H	-
X ¹	-	G-25	H	-
X ¹	-	G-26	H	-
X ¹	-	G-27	H	-
X ¹	-	G-28	H	-
X ¹	-	G-29	H	-
X ¹	-	G-30	H	-
X ¹	-	G-31	H	-
X ¹	-	G-32	H	-
X ¹	-	G-33	H	-
X ¹	-	G-34	H	-
X ¹	-	G-35	H	-
X ¹	-	G-36	H	-
X ¹	-	G-37	H	-
X ¹	-	G-38	H	-
X ¹	-	G-39	H	H
X ¹	-	G-40	H	-
X ¹	-	G-41	H	-
X ¹	-	G-42	H	H
X ¹	-	G-43	H	H
X ¹	-	G-44	H	-
X ¹	-	G-45	H	-
X ¹	-	G-46	H	-
X ¹	-	G-47	H	-
X ¹	-	G-48	H	H
X ¹	-	G-49	H	-
X ¹	-	G-50	H	-
X ¹	-	G-51	H	H
X ¹	-	G-52	H	-
X ¹	-	G-53	H	-
X ¹	-	G-54	H	H
X ¹	-	G-55	H	-
X ¹	-	G-56	H	-
X ¹	-	G-57	H	-
X ¹	-	G-58	H	H

<u>X</u>	<u>(R²)_n</u>	<u>G</u>	<u>R^{3a}</u>	<u>R^{11a}</u>
X ¹	-	G-59	H	H
X ¹	-	G-2	Me	-
X ¹	-	G-2	Cl	-
X ¹	-	G-2	F	-
X ¹	-	G-2	CF ₃	-
X ¹	-	G-14	n-Pr	-
X ¹	-	G-3	H	Me
X ¹	-	G-3	H	n-Pr
X ¹	-	G-26	5-Me	-
X ¹	2-Me	G-1	H	-
X ¹	3-Me	G-1	H	-
X ¹	2,6-二-Me	G-1	H	-
X ¹	3,5-二-Me	G-1	H	-
X ¹	3-n-Bu	G-1	H	-
X ¹	4-MeO	G-1	H	-
X ¹	4-OH	G-1	H	-
X ¹	4-Cl	G-1	H	-
X ¹	4-Br	G-1	H	-
X ¹	4-CN	G-1	H	-
X ²	-	G-1	H	-
X ²	-	G-2	H	-
X ²	-	G-3	H	H
X ²	-	G-4	H	-
X ²	-	G-5	H	-
X ²	-	G-6	H	H
X ²	-	G-7	H	-
X ²	-	G-8	H	-
X ²	-	G-9	H	H
X ²	-	G-10	H	-
X ²	-	G-11	H	-
X ²	-	G-12	H	H
X ²	-	G-13	H	H
X ²	-	G-14	H	-
X ²	-	G-15	H	-
X ²	-	G-16	H	H

<u>X</u>	<u>(R²)_n</u>	<u>G</u>	<u>R^{3a}</u>	<u>R^{11a}</u>
X ²	-	G-17	H	-
X ²	-	G-18	H	-
X ²	-	G-19	H	H
X ²	-	G-20	H	-
X ²	-	G-21	H	-
X ²	-	G-22	H	H
X ²	-	G-23	H	-
X ²	-	G-24	H	-
X ²	-	G-31	H	-
X ²	-	G-32	H	-
X ²	-	G-33	H	-
X ²	-	G-34	H	-
X ²	-	G-35	H	-
X ²	-	G-37	H	-
X ²	-	G-38	H	-
X ²	-	G-39	H	H
X ²	-	G-40	H	-
X ²	-	G-41	H	-
X ²	-	G-42	H	H
X ²	-	G-43	H	H
X ²	-	G-44	H	-
X ²	-	G-45	H	-
X ²	-	G-46	H	-
X ²	-	G-47	H	-
X ²	-	G-48	H	H
X ²	-	G-49	H	-
X ²	-	G-50	H	-
X ²	-	G-51	H	H
X ²	-	G-52	H	-
X ²	-	G-53	H	-
X ²	-	G-54	H	H
X ²	-	G-2	Me	-
X ²	-	G-2	Cl	-
X ²	-	G-2	F	-
X ²	-	G-2	CF ₃	-

<u>X</u>	<u>(R²)_n</u>	<u>G</u>	<u>R^{3a}</u>	<u>R^{11a}</u>
X ²	-	G-14	n-Pr	-
X ²	-	G-3	H	Me
X ²	-	G-3	H	n-Pr
X ²	2-Me	G-1	H	-
X ²	3-Me	G-1	H	-
X ²	2,6-二-Me	G-1	H	-
X ²	3,5-二-Me	G-1	H	-
X ²	3-n-Bu	G-1	H	-
X ³	-	G-1	H	-
X ³	-	G-2	H	-
X ³	-	G-3	H	H
X ³	-	G-4	H	-
X ³	-	G-5	H	-
X ³	-	G-6	H	H
X ³	-	G-7	H	-
X ³	-	G-8	H	-
X ³	-	G-9	H	H
X ³	-	G-10	H	-
X ³	-	G-11	H	-
X ³	-	G-12	H	H
X ³	-	G-13	H	H
X ³	-	G-14	H	-
X ³	-	G-15	H	-
X ³	-	G-16	H	H
X ³	-	G-17	H	-
X ³	-	G-18	H	-
X ³	-	G-19	H	H
X ³	-	G-20	H	-
X ³	-	G-21	H	-
X ³	-	G-22	H	H
X ³	-	G-23	H	-
X ³	-	G-24	H	-
X ³	-	G-31	H	-
X ³	-	G-32	H	-
X ³	-	G-33	H	-

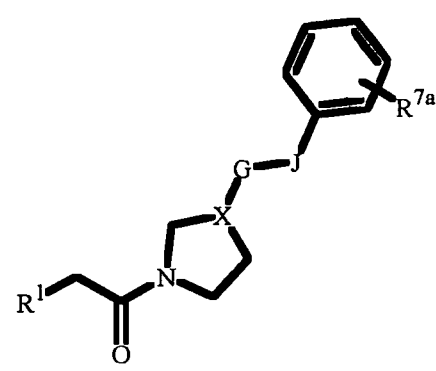
<u>X</u>	<u>(R²)_n</u>	<u>G</u>	<u>R^{3a}</u>	<u>R^{11a}</u>
X ³	-	G-34	H	-
X ³	-	G-35	H	-
X ³	-	G-37	H	-
X ³	-	G-38	H	-
X ³	-	G-39	H	H
X ³	-	G-40	H	-
X ³	-	G-41	H	-
X ³	-	G-42	H	H
X ³	-	G-43	H	H
X ³	-	G-44	H	-
X ³	-	G-45	H	-
X ³	-	G-46	H	-
X ³	-	G-47	H	-
X ³	-	G-48	H	H
X ³	-	G-49	H	-
X ³	-	G-50	H	-
X ³	-	G-51	H	H
X ³	-	G-52	H	-
X ³	-	G-53	H	-
X ³	-	G-54	H	H
X ³	-	G-2	Me	-
X ³	-	G-2	Cl	-
X ³	-	G-2	F	-
X ³	-	G-2	CF ₃	-
X ³	-	G-14	n-Pr	-
X ³	-	G-3	H	Me
X ³	-	G-3	H	n-Pr
X ³	2-Me	G-1	H	-
X ³	3-Me	G-1	H	-
X ³	2,6-二-Me	G-1	H	-
X ³	3,5-二-Me	G-1	H	-
X ³	3-n-Bu	G-1	H	-
X ³	5-Me	G-1	H	-
X ³	6-Me	G-1	H	-
X ⁴	-	G-1	H	-

<u>X</u>	<u>(R²)_n</u>	<u>G</u>	<u>R^{3a}</u>	<u>R^{11a}</u>
X ⁵	-	G-1	H	-
X ⁶	-	G-1	H	-
X ⁷	-	G-1	H	-
X ⁸	-	G-1	H	-
X ⁹	-	G-1	H	-

* X, G, R^{3a}及R^{11a}在此表之化合物中之定義，均如發明內容與上文具體實施例中之展示表2中之定義。

在(R²)_n欄中之破折號"-"表示沒有取代基。

表 4*



5

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G^{**}</u>	<u>J^{***}</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-1 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-2 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G^{**}</u>	<u>J^{***}</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-4 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-8 (5/3)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-9 (5/3)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ¹	G-1	J-14 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ¹	G-1	J-15 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-16 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-22 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-24 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-25 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-28 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-37 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-38 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-39 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-40 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-69 (1/3)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-69 (1/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Me
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G^{**}</u>	<u>J^{***}</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	2-Cl
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-21	J-1 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-1 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-2 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-4 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-8 (5/3)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-9 (5/3)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-14 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-15 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-16 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-22 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-24 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-25 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ¹	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ¹	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-28 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-37 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-38 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	-	H



<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ¹	G-2	J-39 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ¹	G-2	J-40 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-69 (1/3)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-69 (1/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ¹	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me

R^1	X	G^{**}	J^{***}	$(R^5)_y$	R^{7a}
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
2,5-二氯苯基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
2,5-二甲基苯基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
3,5-二甲基吡唑-1-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
2,5-二氯苯基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
2,5-二甲基苯基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
3,5-二甲基吡唑-1-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
2,5-二氯苯基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2,5-二甲基苯基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
3,5-二甲基吡唑-1-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^1	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2,5-二氯苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H



<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ¹	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-1 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-1 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-1 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-1 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-1	J-1 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-1 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-1 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-1 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-1 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-1 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-1	J-1 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ²	G-1	J-1 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-2 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-2 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-2 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-2 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-1	J-2 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-2 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-2 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-2 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-2 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-2 (2/4)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G^{**}</u>	<u>J^{***}</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-2 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-2 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-4 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-4 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-4 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-4 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-4 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-4 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-4 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-4 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-4 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-4 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-4 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-4 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-8 (5/3)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-8 (5/3)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-8 (5/3)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-8 (5/3)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-8 (5/3)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-8 (5/3)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-8 (5/3)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-8 (5/3)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-8 (5/3)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-8 (5/3)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-8 (5/3)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-8 (5/3)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-9 (5/3)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-9 (5/3)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-9 (5/3)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-9 (5/3)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-9 (5/3)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-9 (5/3)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-9 (5/3)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-9 (5/3)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-9 (5/3)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-9 (5/3)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-9 (5/3)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-9 (5/3)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ²	G-1	J-12 (3/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-14 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-14 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-14 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-14 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-1	J-14 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-14 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-14 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-14 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-14 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-14 (3/5)	-	H

R^1	X	G^{**}	J^{***}	$(R^5)_y$	R^{7a}
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X^2	G-1	J-14 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X^2	G-1	J-14 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X^2	G-1	J-15 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-15 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X^2	G-1	J-15 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-15 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X^2	G-1	J-15 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-15 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-15 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-15 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-15 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-15 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X^2	G-1	J-15 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X^2	G-1	J-15 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X^2	G-1	J-16 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-16 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X^2	G-1	J-16 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-16 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X^2	G-1	J-16 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-16 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-16 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-16 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-16 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-16 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X^2	G-1	J-16 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X^2	G-1	J-16 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X^2	G-1	J-22 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-22 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X^2	G-1	J-22 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-22 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X^2	G-1	J-22 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-22 (2/4)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-22 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-22 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-22 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-22 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-22 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-22 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-24 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-24 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-24 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-24 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-24 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-24 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-24 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-24 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-24 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-24 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-24 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-24 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-25 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-25 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-25 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-25 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-25 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-25 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-25 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-25 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-25 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-25 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-25 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-25 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	-	H



<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-26 (2/4)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G^{**}</u>	<u>J^{***}</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-26 (2/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-28 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-28 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-28 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-28 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-28 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-28 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-28 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-28 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-28 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-28 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-28 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-28 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-37 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-37 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-37 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-37 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-37 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-37 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-37 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-37 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-37 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-37 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-37 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-37 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-38 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-38 (2/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-38 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-38 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-1	J-38 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-38 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-38 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-38 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-38 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-38 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-1	J-38 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)吡啶-2-基	X ²	G-1	J-38 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-39 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-39 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-39 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-39 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-1	J-39 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-39 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-39 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-39 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-39 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-39 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-1	J-39 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ²	G-1	J-39 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-40 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-40 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-40 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-40 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-1	J-40 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-40 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-40 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-40 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-40 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-40 (3/5)	-	H

R^1	X	G^{**}	J^{***}	$(R^5)_y$	R^{7a}
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X^2	G-1	J-40 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X^2	G-1	J-40 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X^2	G-1	J-69 (1/3)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-69 (1/3)	-	H
2,5-二甲基苯基	X^2	G-1	J-69 (1/3)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-69 (1/3)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X^2	G-1	J-69 (1/3)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^2	G-1	J-69 (1/3)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^2	G-1	J-69 (1/3)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^2	G-1	J-69 (1/3)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^2	G-1	J-69 (1/3)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^2	G-1	J-69 (1/3)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X^2	G-1	J-69 (1/3)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X^2	G-1	J-69 (1/3)	-	H
2,5-二氯苯基	X^2	G-1	J-69 (1/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-69 (1/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X^2	G-1	J-69 (1/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-69 (1/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X^2	G-1	J-69 (1/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^2	G-1	J-69 (1/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^2	G-1	J-69 (1/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^2	G-1	J-69 (1/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^2	G-1	J-69 (1/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^2	G-1	J-69 (1/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X^2	G-1	J-69 (1/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X^2	G-1	J-69 (1/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
2,5-二甲基苯基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
3,5-二甲基吡唑-1-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G^{**}</u>	<u>J^{***}</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Me
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	3-Me
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Me
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl

R^1	X	G^{**}	J^{***}	$(R^5)_y$	R^{7a}
2,5-二甲基苯基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
3,5-二甲基吡啶-1-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	2-Cl
2,5-二氯苯基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
2,5-二甲基苯基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
3,5-二甲基吡啶-1-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X^2	G-1	J-11 (3/5)	-	4-Cl
2,5-二氯苯基	X^2	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Me
2,5-二甲基苯基	X^2	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X^2	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Me
3,5-二甲基吡啶-1-基	X^2	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X^2	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Me

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Me
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	3-Me
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Me
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Cl
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Cl
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Cl



<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Cl
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	2-Cl
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	5-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G^{**}</u>	<u>J^{***}</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ²	G-1	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-1 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-1 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-1 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-1 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-2	J-1 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-1 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-1 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-1 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-1 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-1 (2/4)	-	H



<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-2	J-1 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-1 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-2 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-2 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-2 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-2 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-2	J-2 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-2 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-2 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-2 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-2 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-2 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-2	J-2 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-2 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-3 (2/4)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-4 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-4 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-4 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-4 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-2	J-4 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-4 (2/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-4 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-4 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-4 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-4 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-4 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-4 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-8 (5/3)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-8 (5/3)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-8 (5/3)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-8 (5/3)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-8 (5/3)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-8 (5/3)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-8 (5/3)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-8 (5/3)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-8 (5/3)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-8 (5/3)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-8 (5/3)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-8 (5/3)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-9 (5/3)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-9 (5/3)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-9 (5/3)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-9 (5/3)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-9 (5/3)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-9 (5/3)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-9 (5/3)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-9 (5/3)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-9 (5/3)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-9 (5/3)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-9 (5/3)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-9 (5/3)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G^{**}</u>	<u>J^{***}</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-12 (3/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-14 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-14 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-14 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-14 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-14 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-14 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-14 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-14 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-14 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-14 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-14 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-14 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-15 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-15 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-15 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-15 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-15 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-15 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-15 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-15 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-15 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-15 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-15 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-15 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-16 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-16 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-16 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-16 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-16 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-16 (2/5)	-	H



<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-16 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-16 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-16 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-16 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-16 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-16 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-22 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-22 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-22 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-22 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-22 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-22 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-22 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-22 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-22 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-22 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-22 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-22 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-24 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-24 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-24 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-24 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-24 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-24 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-24 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-24 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-24 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-24 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-24 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-24 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-25 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-25 (2/4)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-25 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-25 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-2	J-25 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-25 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-25 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-25 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-25 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-25 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-2	J-25 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ²	G-2	J-25 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	-	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H



<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-26 (2/4)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-26 (2/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-28 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-28 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-28 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-28 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-28 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-28 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-28 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-28 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-28 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-28 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-28 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-28 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G^{**}</u>	<u>J^{***}</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-30 (3/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-36 (3/5)	1-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-37 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-37 (2/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-37 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-37 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-37 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-37 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-37 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-37 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-37 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-37 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-37 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-37 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-38 (2/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-38 (2/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-38 (2/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-38 (2/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-38 (2/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-38 (2/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-38 (2/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-38 (2/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-38 (2/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-38 (2/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-38 (2/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-38 (2/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-39 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-39 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-39 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-39 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-39 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-39 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-39 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-39 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-39 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-39 (3/5)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-39 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-39 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-40 (3/5)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-40 (3/5)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-40 (3/5)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-40 (3/5)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-40 (3/5)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-40 (3/5)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-40 (3/5)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-40 (3/5)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-40 (3/5)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-40 (3/5)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-40 (3/5)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-40 (3/5)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-69 (1/3)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-69 (1/3)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-69 (1/3)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-69 (1/3)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-69 (1/3)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-69 (1/3)	-	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-69 (1/3)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-69 (1/3)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-69 (1/3)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-69 (1/3)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-69 (1/3)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-69 (1/3)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-69 (1/4)	-	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-69 (1/4)	-	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-69 (1/4)	-	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-69 (1/4)	-	H
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-69 (1/4)	-	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-69 (1/4)	-	H

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-69 (1/4)	-	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-69 (1/4)	-	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-69 (1/4)	-	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-69 (1/4)	-	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-2	J-69 (1/4)	-	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ²	G-2	J-69 (1/4)	-	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Me
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	3-Me
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Me
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	2-Cl
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-11 (3/5)	-	4-Cl
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Me
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	3-Me
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me

<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Me
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	2-Cl
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
3,5-二甲基吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
5-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
5-氯基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
5-溴基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
5-乙基-3-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
3,5-雙-(三氟甲基)吡唑-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	-	4-Cl
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H



<u>R¹</u>	<u>X</u>	<u>G**</u>	<u>J***</u>	<u>(R⁵)_y</u>	<u>R^{7a}</u>
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	5-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-5-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪啶-2-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4-Me	H
2,5-二氯苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
2-氯基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
2,5-二甲基苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
2-甲基-5-(三氟甲基)苯基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
3,5-二甲基吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-甲基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-氯基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-溴基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
5-乙基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
3,5-雙-(三氟甲基)吡啶-1-基	X ²	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H

R^1	X	G^{**}	J^{***}	$(R^5)_y$	R^{7a}
1-甲基-3-(三氟甲基)吡唑-5-基	X^2	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H
1-甲基-4-(三氟甲基)咪唑-2-基	X^2	G-2	J-29 (3/5)	4,4-二-Me	H

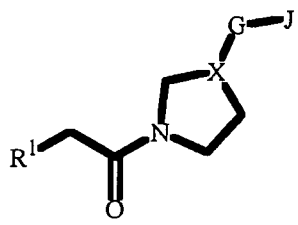
* G與J在此表之化合物中之定義，均如上文具體實施例中之展示表2與3中之定義。 $(R^5)_y$ 欄係指於展示表3中，在J基團上所示之取代基 $(R^5)_x$ ，而非被此表標題結構中所示之 R^{7a} 取代之苯環。 R^{7a} 可選自H (以表示沒有取代在苯環上)以及關於 R^7 所定義之取代基。在 $(R^5)_y$ 欄中之破折號“-”表示除了被 R^{7a} 取代之苯環以外，在J上沒有取代。

** 在G中之 R^{3a} 取代基為H。

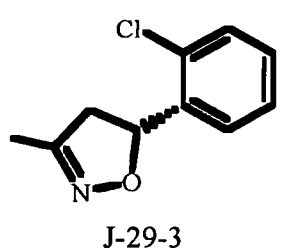
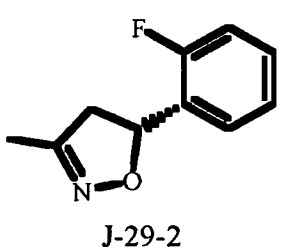
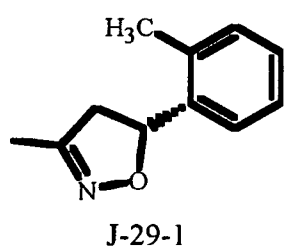
*** 在括弧中之數字係指在環J上之連接點。

10 第一個數目為對環G之連接點；第二個數目為對苯環之連接點。

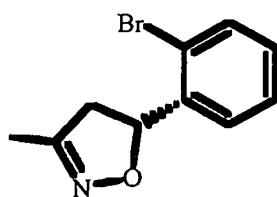
表 5



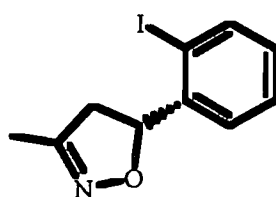
其中 J 為



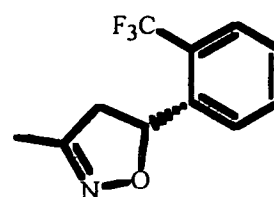
15



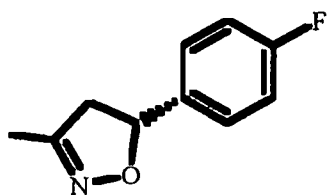
J-29-4



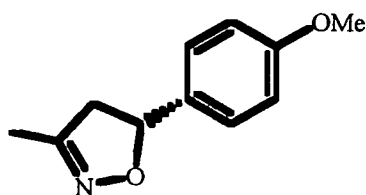
J-29-5



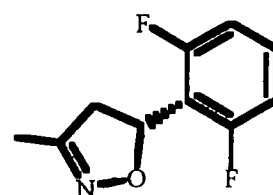
J-29-6



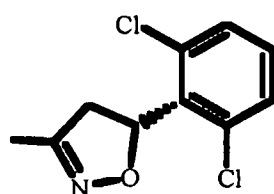
J-29-7



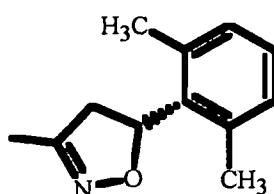
J-29-8



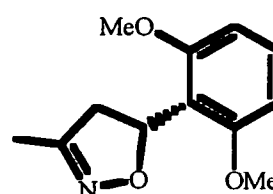
J-29-9



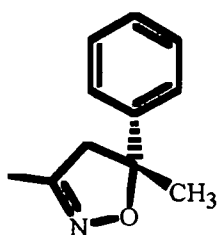
J-29-10



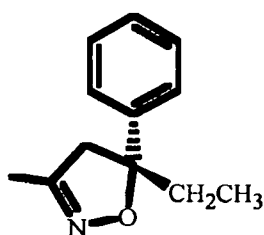
J-29-11



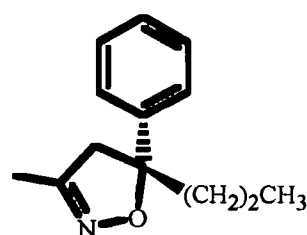
J-29-12



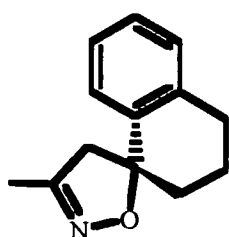
J-29-13



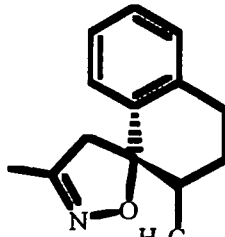
J-29-14



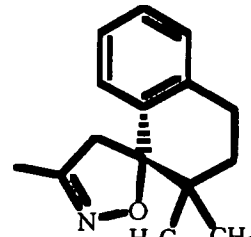
J-29-15



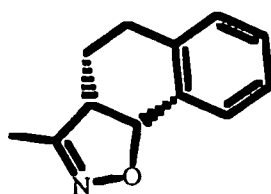
J-29-16



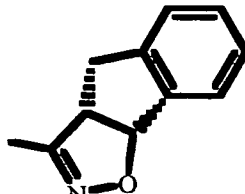
J-29-17



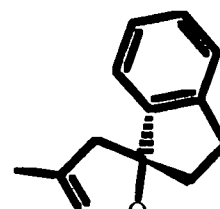
J-29-18



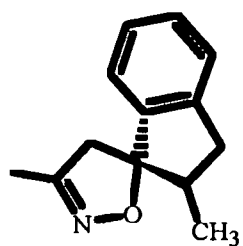
J-29-19



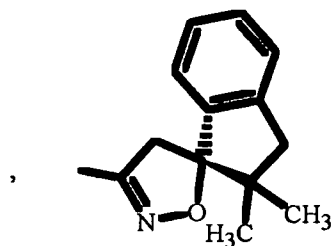
J-29-20



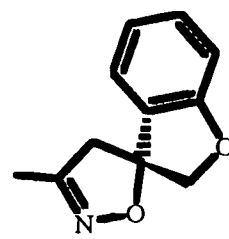
J-29-21



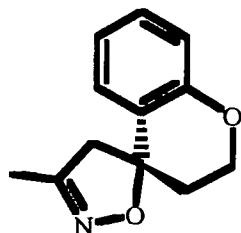
J-29-22



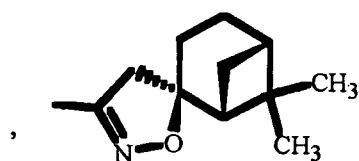
J-29-23



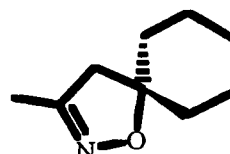
J-29-24



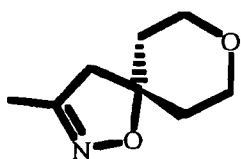
J-29-25



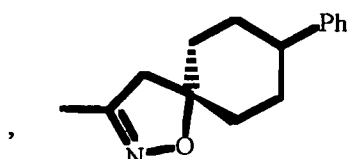
J-29-26



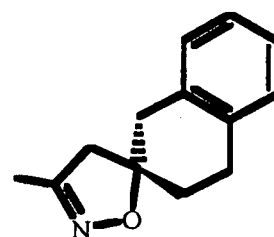
J-29-27



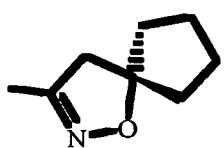
J-29-28



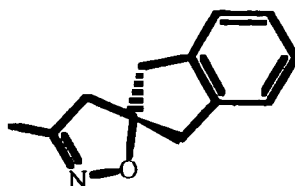
J-29-29



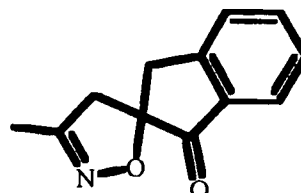
J-29-30



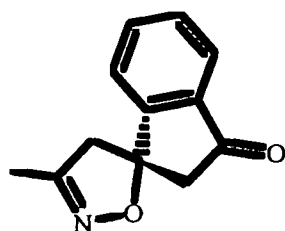
J-29-31



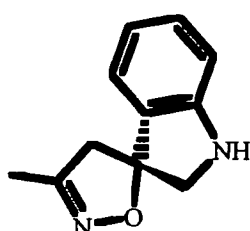
J-29-32



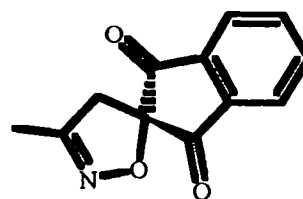
J-29-33



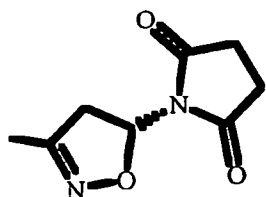
J-29-34



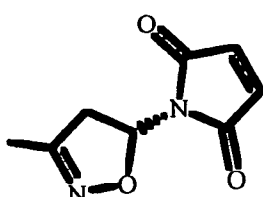
J-29-35



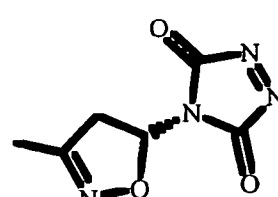
J-29-36



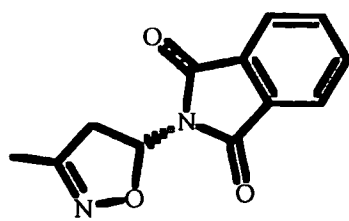
J-29-37



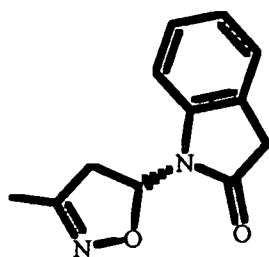
J-29-38



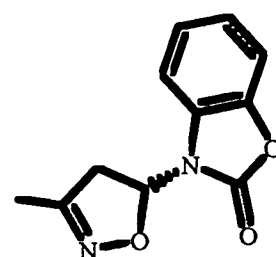
J-29-39



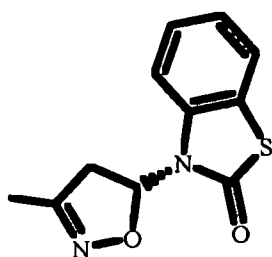
J-29-40



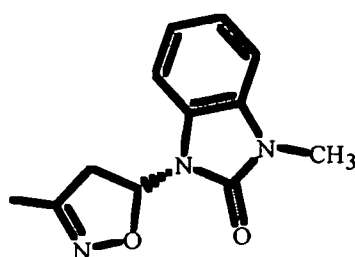
J-29-41



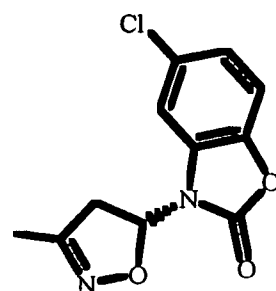
J-29-42



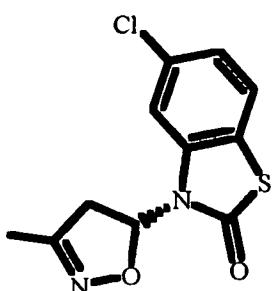
J-29-43



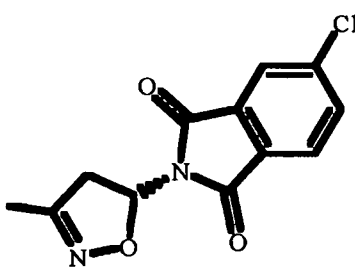
J-29-44



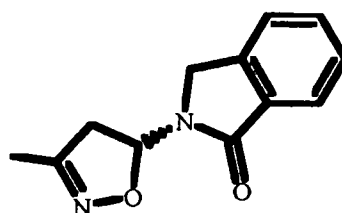
J-29-45



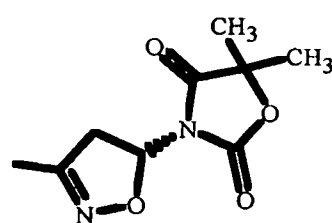
J-29-46



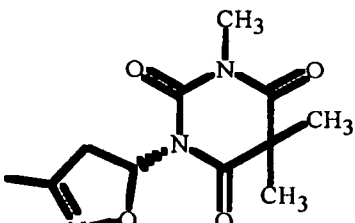
J-29-47



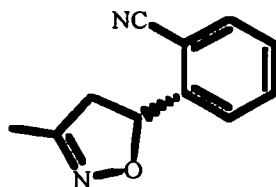
J-29-48



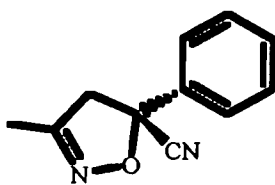
J-29-49



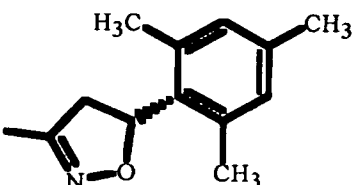
J-29-50



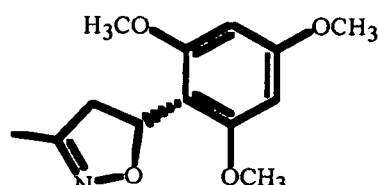
J-29-51



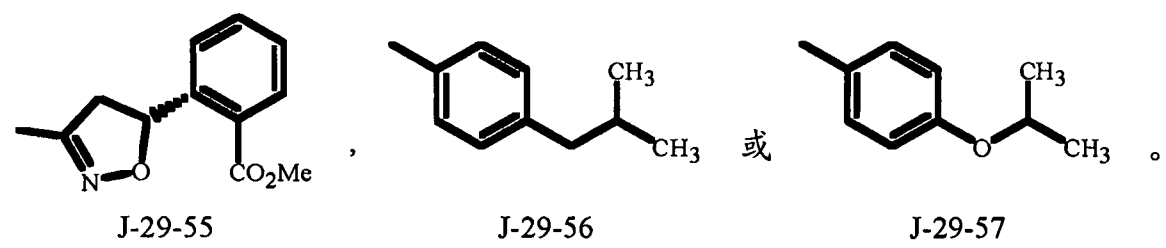
J-29-52



J-29-53



J-29-54



R¹ 為 2,5-二氯苯基；X 為 X¹；G* 為 G-1。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 2,5-二氯苯基；X 為 X²；G* 為 G-1。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 2,5-二氯苯基；X 為 X¹；G* 為 G-2。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-3	J-29-5	J-29-7	J-29-9	J-29-11
J-29-2	J-29-4	J-29-6	J-29-8	J-29-10	J-29-12

J	J	J	J	J	J
J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45	J-29-53
J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46	J-29-54
J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47	J-29-55
J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48	J-29-56
J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41	J-29-49	J-29-57
J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42	J-29-50	
J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43	J-29-51	
J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44	J-29-52	

R¹ 為 2,5-二 氯 苯 基 ； X 為 X² ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 2-氯 基 -5-(三 氟 甲 基)苯 基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 2-氯 基 -5-(三 氟 甲 基)苯 基 ； X 為 X² ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 2-氯基 -5-(三 氟 甲 基)苯 基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 2-氯基 -5-(三 氟 甲 基)苯 基 ； X 為 X² ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 2,5-二 甲 基 苯 基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 2,5-二 甲 基 苯 基 ； X 為 X² ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 2,5-二 甲 基 苯 基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-9	J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41
J-29-2	J-29-10	J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42
J-29-3	J-29-11	J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43
J-29-4	J-29-12	J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44
J-29-5	J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45
J-29-6	J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46
J-29-7	J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47
J-29-8	J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48

J	J	J	J	J	J
J-29-49	J-29-51	J-29-53	J-29-55	J-29-57	
J-29-50	J-29-52	J-29-54	J-29-56		

R¹ 為 2,5-二 甲 基 苯 基 ； X 為 X² ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 2-甲 基 -5-(三 氟 甲 基)苯 基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 2-甲 基 -5-(三 氟 甲 基)苯 基 ； X 為 X² ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-6	J-29-11	J-29-16	J-29-21	J-29-26
J-29-2	J-29-7	J-29-12	J-29-17	J-29-22	J-29-27
J-29-3	J-29-8	J-29-13	J-29-18	J-29-23	J-29-28
J-29-4	J-29-9	J-29-14	J-29-19	J-29-24	J-29-29
J-29-5	J-29-10	J-29-15	J-29-20	J-29-25	J-29-30

J	J	J	J	J	J
J-29-31	J-29-36	J-29-41	J-29-46	J-29-51	J-29-56
J-29-32	J-29-37	J-29-42	J-29-47	J-29-52	J-29-57
J-29-33	J-29-38	J-29-43	J-29-48	J-29-53	
J-29-34	J-29-39	J-29-44	J-29-49	J-29-54	
J-29-35	J-29-40	J-29-45	J-29-50	J-29-55	

R¹ 為 2-甲基 -5-(三 氟 甲 基)苯 基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 2-甲 基 -5-(三 氟 甲 基)苯 基 ； X 為 X² ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3,5-二 甲 基 吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-3	J-29-5	J-29-7	J-29-9	J-29-11
J-29-2	J-29-4	J-29-6	J-29-8	J-29-10	J-29-12

J	J	J	J	J	J
J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45	J-29-53
J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46	J-29-54
J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47	J-29-55
J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48	J-29-56
J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41	J-29-49	J-29-57
J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42	J-29-50	
J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43	J-29-51	
J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44	J-29-52	

R¹ 為 3,5-二 甲 基 吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3,5-二 甲 基 吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3,5-二 甲 基 吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3,5-二氯吡啶 -1-基； X 為 X¹； G* 為 G-1。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3,5-二氯吡啶 -1-基； X 為 X²； G* 為 G-1。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3,5-二氯吡啶 -1-基； X 為 X¹； G* 為 G-2。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3,5-二氯吡啶 -1-基； X 為 X²； G* 為 G-2。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3,5-二溴基吡啶 -1-基； X 為 X¹； G* 為 G-1。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-9	J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41
J-29-2	J-29-10	J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42
J-29-3	J-29-11	J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43
J-29-4	J-29-12	J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44
J-29-5	J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45
J-29-6	J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46
J-29-7	J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47
J-29-8	J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48

J	J	J	J	J	J
J-29-49	J-29-51	J-29-53	J-29-55	J-29-57	
J-29-50	J-29-52	J-29-54	J-29-56		

R¹ 為 3,5-二溴基吡啶 -1-基； X 為 X²； G* 為 G-1。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3,5-二溴基吡啶 -1-基； X 為 X¹； G* 為 G-2。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3,5-二溴基吡啶 -1-基； X 為 X²； G* 為 G-2。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-6	J-29-11	J-29-16	J-29-21	J-29-26
J-29-2	J-29-7	J-29-12	J-29-17	J-29-22	J-29-27
J-29-3	J-29-8	J-29-13	J-29-18	J-29-23	J-29-28
J-29-4	J-29-9	J-29-14	J-29-19	J-29-24	J-29-29
J-29-5	J-29-10	J-29-15	J-29-20	J-29-25	J-29-30

J	J	J	J	J	J
J-29-31	J-29-36	J-29-41	J-29-46	J-29-51	J-29-56
J-29-32	J-29-37	J-29-42	J-29-47	J-29-52	J-29-57
J-29-33	J-29-38	J-29-43	J-29-48	J-29-53	
J-29-34	J-29-39	J-29-44	J-29-49	J-29-54	
J-29-35	J-29-40	J-29-45	J-29-50	J-29-55	

R¹ 為 5-甲 基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-甲 基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-甲 基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-3	J-29-5	J-29-7	J-29-9	J-29-11
J-29-2	J-29-4	J-29-6	J-29-8	J-29-10	J-29-12

J	J	J	J	J	J
J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45	J-29-53
J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46	J-29-54
J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47	J-29-55
J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48	J-29-56
J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41	J-29-49	J-29-57
J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42	J-29-50	
J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43	J-29-51	
J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44	J-29-52	

R¹ 為 5-甲基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-氯 基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-氯 基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-氯基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-氯基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-溴基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-溴基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-溴基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-9	J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41
J-29-2	J-29-10	J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42
J-29-3	J-29-11	J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43
J-29-4	J-29-12	J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44
J-29-5	J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45
J-29-6	J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46
J-29-7	J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47
J-29-8	J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48

J	J	J	J	J	J
J-29-49	J-29-51	J-29-53	J-29-55	J-29-57	
J-29-50	J-29-52	J-29-54	J-29-56		

R¹ 為 5-溴基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-乙 基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-乙 基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-6	J-29-11	J-29-16	J-29-21	J-29-26
J-29-2	J-29-7	J-29-12	J-29-17	J-29-22	J-29-27
J-29-3	J-29-8	J-29-13	J-29-18	J-29-23	J-29-28
J-29-4	J-29-9	J-29-14	J-29-19	J-29-24	J-29-29
J-29-5	J-29-10	J-29-15	J-29-20	J-29-25	J-29-30

J	J	J	J	J	J
J-29-31	J-29-36	J-29-41	J-29-46	J-29-51	J-29-56
J-29-32	J-29-37	J-29-42	J-29-47	J-29-52	J-29-57
J-29-33	J-29-38	J-29-43	J-29-48	J-29-53	
J-29-34	J-29-39	J-29-44	J-29-49	J-29-54	
J-29-35	J-29-40	J-29-45	J-29-50	J-29-55	

R¹ 為 5-乙 基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-乙 基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3,5-雙 -(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-3	J-29-5	J-29-7	J-29-9	J-29-11
J-29-2	J-29-4	J-29-6	J-29-8	J-29-10	J-29-12

J	J	J	J	J	J
J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45	J-29-53
J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46	J-29-54
J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47	J-29-55
J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48	J-29-56
J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41	J-29-49	J-29-57
J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42	J-29-50	
J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43	J-29-51	
J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44	J-29-52	

R¹ 為 3,5-雙 -(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3,5-雙 -(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3,5-雙 -(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3-甲基 -5-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3-甲基 -5-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3-甲基 -5-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3-甲基 -5-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3-氯 基 -5-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-9	J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41
J-29-2	J-29-10	J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42
J-29-3	J-29-11	J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43
J-29-4	J-29-12	J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44
J-29-5	J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45
J-29-6	J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46
J-29-7	J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47
J-29-8	J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48

J	J	J	J	J	J
J-29-49	J-29-51	J-29-53	J-29-55	J-29-57	
J-29-50	J-29-52	J-29-54	J-29-56		

R¹ 為 3-氯基 -5-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3-氯基 -5-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-y1 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3-氯基 -5-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-6	J-29-11	J-29-16	J-29-21	J-29-26
J-29-2	J-29-7	J-29-12	J-29-17	J-29-22	J-29-27
J-29-3	J-29-8	J-29-13	J-29-18	J-29-23	J-29-28
J-29-4	J-29-9	J-29-14	J-29-19	J-29-24	J-29-29
J-29-5	J-29-10	J-29-15	J-29-20	J-29-25	J-29-30

J	J	J	J	J	J
J-29-31	J-29-36	J-29-41	J-29-46	J-29-51	J-29-56
J-29-32	J-29-37	J-29-42	J-29-47	J-29-52	J-29-57
J-29-33	J-29-38	J-29-43	J-29-48	J-29-53	
J-29-34	J-29-39	J-29-44	J-29-49	J-29-54	
J-29-35	J-29-40	J-29-45	J-29-50	J-29-55	

R¹ 為 3-溴基 -5-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3-溴基 -5-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 3-溴基 -5-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-3	J-29-5	J-29-7	J-29-9	J-29-11
J-29-2	J-29-4	J-29-6	J-29-8	J-29-10	J-29-12

J	J	J	J	J	J
J-29-13	J-29-21	J-29-29	J-29-37	J-29-45	J-29-53
J-29-14	J-29-22	J-29-30	J-29-38	J-29-46	J-29-54
J-29-15	J-29-23	J-29-31	J-29-39	J-29-47	J-29-55
J-29-16	J-29-24	J-29-32	J-29-40	J-29-48	J-29-56
J-29-17	J-29-25	J-29-33	J-29-41	J-29-49	J-29-57
J-29-18	J-29-26	J-29-34	J-29-42	J-29-50	
J-29-19	J-29-27	J-29-35	J-29-43	J-29-51	
J-29-20	J-29-28	J-29-36	J-29-44	J-29-52	

R¹ 為 3-溴基 -5-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-甲 氧 基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-甲 氧 基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-甲氧基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基；X 為 X¹；G* 為 G-2。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-甲氧基-3-(三氟甲基)吡啶-1-基；X 為 X²；G* 為 G-2。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	



R¹ 為 5-二 氟 甲 氧 基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為

G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-二 氟 甲 氧 基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為

G-1 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

R¹ 為 5-二 氟 甲 氧 基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X¹ ； G* 為

G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-5	J-29-9	J-29-13	J-29-17	J-29-21
J-29-2	J-29-6	J-29-10	J-29-14	J-29-18	J-29-22
J-29-3	J-29-7	J-29-11	J-29-15	J-29-19	J-29-23
J-29-4	J-29-8	J-29-12	J-29-16	J-29-20	J-29-24

J	J	J	J	J	J
J-29-25	J-29-31	J-29-37	J-29-43	J-29-49	J-29-55
J-29-26	J-29-32	J-29-38	J-29-44	J-29-50	J-29-56
J-29-27	J-29-33	J-29-39	J-29-45	J-29-51	J-29-57
J-29-28	J-29-34	J-29-40	J-29-46	J-29-52	
J-29-29	J-29-35	J-29-41	J-29-47	J-29-53	
J-29-30	J-29-36	J-29-42	J-29-48	J-29-54	

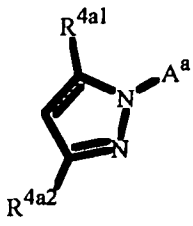
R¹ 為 5-二 氟 甲 氧 基 -3-(三 氟 甲 基)吡 啶 -1-基 ； X 為 X² ； G* 為 G-2 。

J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-56
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-57
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	

上文表 5 係確認特定化合物，其包含 J 基團，選自 J-29-1 至 J-29-57 (意即 J-29 之特定實例)。因許多 J-29-1 至 J-29-57 包含一個對掌中心，故此等 J 基團係以特定對掌異構物組態圖解，其在一些情況中可提供最大殺真菌活性。熟諳此藝者立即明瞭關於所列示各化合物之對映體 (意即相反對掌異構物)，且進一步明瞭對掌異構物可以純對掌異構物，或以富含一種對掌異構物之混合物，或以外消旋混合物存在。

** 在 G 中之 R^{3a} 取代基為 H 。

表 6



R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
Me	Me	H	Me	Me	CH ₂ CO ₂ Et
Me	Et	H	Me	Et	CH ₂ CO ₂ Et
Me	Cl	H	Me	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
Me	Br	H	Me	Br	CH ₂ CO ₂ Et
Me	I	H	Me	I	CH ₂ CO ₂ Et
Me	CF ₂ H	H	Me	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
Me	CF ₃	H	Me	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
Me	CF ₃ CH ₂	H	Me	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Me	CF ₃ CF ₂	H	Me	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Me	CCl ₃	H	Me	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
Me	MeO	H	Me	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
Et	Me	H	Et	Me	CH ₂ CO ₂ Et
Et	Et	H	Et	Et	CH ₂ CO ₂ Et
Et	Cl	H	Et	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
Et	Br	H	Et	Br	CH ₂ CO ₂ Et
Et	I	H	Et	I	CH ₂ CO ₂ Et
Et	CF ₂ H	H	Et	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
Et	CF ₃	H	Et	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
Et	CF ₃ CH ₂	H	Et	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Et	CF ₃ CF ₂	H	Et	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Et	CCl ₃	H	Et	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
Et	MeO	H	Et	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	Me	H	Cl	Me	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	Et	H	Cl	Et	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	Cl	H	Cl	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	Br	H	Cl	Br	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	I	H	Cl	I	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	CF ₂ H	H	Cl	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	CF ₃	H	Cl	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et

R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
Cl	CF ₃ CH ₂	H	Cl	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	CF ₃ CF ₂	H	Cl	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	CCl ₃	H	Cl	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
Cl	MeO	H	Cl	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
Br	Me	H	Br	Me	CH ₂ CO ₂ Et
Br	Et	H	Br	Et	CH ₂ CO ₂ Et
Br	Cl	H	Br	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
Br	Br	H	Br	Br	CH ₂ CO ₂ Et
Br	I	H	Br	I	CH ₂ CO ₂ Et
Br	CF ₂ H	H	Br	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
Br	CF ₃	H	Br	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
Br	CF ₃ CH ₂	H	Br	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Br	CF ₃ CF ₂	H	Br	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
Br	CCl ₃	H	Br	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
Br	MeO	H	Br	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
I	Me	H	I	Me	CH ₂ CO ₂ Et
I	Et	H	I	Et	CH ₂ CO ₂ Et
I	Cl	H	I	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
I	Br	H	I	Br	CH ₂ CO ₂ Et
I	I	H	I	I	CH ₂ CO ₂ Et
I	CF ₂ H	H	I	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
I	CF ₃	H	I	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
I	CF ₃ CH ₂	H	I	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
I	CF ₃ CF ₂	H	I	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
I	CCl ₃	H	I	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
I	MeO	H	I	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	Me	H	CF ₂ H	Me	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	Et	H	CF ₂ H	Et	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	Cl	H	CF ₂ H	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	Br	H	CF ₂ H	Br	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	I	H	CF ₂ H	I	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	CF ₂ H	H	CF ₂ H	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	CF ₃	H	CF ₂ H	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	CF ₃ CH ₂	H	CF ₂ H	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	CF ₃ CF ₂	H	CF ₂ H	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	CCl ₃	H	CF ₂ H	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₂ H	MeO	H	CF ₂ H	MeO	CH ₂ CO ₂ Et

R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
CF ₃	Me	H	CF ₃	Me	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	Et	H	CF ₃	Et	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	Cl	H	CF ₃	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	Br	H	CF ₃	Br	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	I	H	CF ₃	I	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	CF ₂ H	H	CF ₃	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	CF ₃ CH ₂	H	CF ₃	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	CF ₃ CF ₂	H	CF ₃	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	CCl ₃	H	CF ₃	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃	MeO	H	CF ₃	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	Me	H	CF ₃ CH ₂	Me	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	Et	H	CF ₃ CH ₂	Et	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	Cl	H	CF ₃ CH ₂	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	Br	H	CF ₃ CH ₂	Br	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	I	H	CF ₃ CH ₂	I	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	CF ₂ H	H	CF ₃ CH ₂	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	CF ₃	H	CF ₃ CH ₂	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	CF ₃ CH ₂	H	CF ₃ CH ₂	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	CF ₃ CF ₂	H	CF ₃ CH ₂	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	CCl ₃	H	CF ₃ CH ₂	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CH ₂	MeO	H	CF ₃ CH ₂	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	Me	H	CF ₃ CF ₂	Me	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	Et	H	CF ₃ CF ₂	Et	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	Cl	H	CF ₃ CF ₂	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	Br	H	CF ₃ CF ₂	Br	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	I	H	CF ₃ CF ₂	I	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	CF ₂ H	H	CF ₃ CF ₂	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	CF ₃	H	CF ₃ CF ₂	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	CF ₃ CH ₂	H	CF ₃ CF ₂	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	CF ₃ CF ₂	H	CF ₃ CF ₂	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	CCl ₃	H	CF ₃ CF ₂	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CF ₃ CF ₂	MeO	H	CF ₃ CF ₂	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	Me	H	CCl ₃	Me	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	Et	H	CCl ₃	Et	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	Cl	H	CCl ₃	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	Br	H	CCl ₃	Br	CH ₂ CO ₂ Et

R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
CCl ₃	I	H	CCl ₃	I	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	CF ₂ H	H	CCl ₃	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	CF ₃	H	CCl ₃	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	CF ₃ CH ₂	H	CCl ₃	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	CF ₃ CF ₂	H	CCl ₃	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	CCl ₃	H	CCl ₃	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
CCl ₃	MeO	H	CCl ₃	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	Me	H	MeO	Me	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	Et	H	MeO	Et	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	Cl	H	MeO	Cl	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	Br	H	MeO	Br	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	I	H	MeO	I	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	CF ₂ H	H	MeO	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	CF ₃	H	MeO	CF ₃	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	CF ₃ CH ₂	H	MeO	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	CF ₃ CF ₂	H	MeO	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	CCl ₃	H	MeO	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ Et
MeO	MeO	H	MeO	MeO	CH ₂ CO ₂ Et
Me	Me	CH ₂ CO ₂ H	Me	Me	CH ₂ C(=O)Cl
Me	Et	CH ₂ CO ₂ H	Me	Et	CH ₂ C(=O)Cl
Me	Cl	CH ₂ CO ₂ H	Me	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
Me	Br	CH ₂ CO ₂ H	Me	Br	CH ₂ C(=O)Cl
Me	I	CH ₂ CO ₂ H	Me	I	CH ₂ C(=O)Cl
Me	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	Me	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
Me	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	Me	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Me	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	Me	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
Me	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	Me	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
Me	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	Me	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Me	MeO	CH ₂ CO ₂ H	Me	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
Et	Me	CH ₂ CO ₂ H	Et	Me	CH ₂ C(=O)Cl
Et	Et	CH ₂ CO ₂ H	Et	Et	CH ₂ C(=O)Cl
Et	Cl	CH ₂ CO ₂ H	Et	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
Et	Br	CH ₂ CO ₂ H	Et	Br	CH ₂ C(=O)Cl
Et	I	CH ₂ CO ₂ H	Et	I	CH ₂ C(=O)Cl
Et	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	Et	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
Et	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	Et	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Et	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	Et	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl

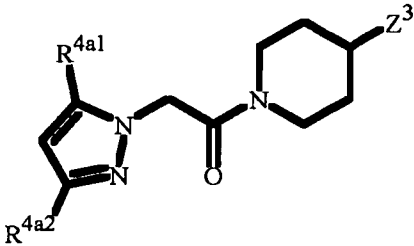
R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
Et	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	Et	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
Et	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	Et	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Et	MeO	CH ₂ CO ₂ H	Et	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	Me	CH ₂ CO ₂ H	Cl	Me	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	Et	CH ₂ CO ₂ H	Cl	Et	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	Cl	CH ₂ CO ₂ H	Cl	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	Br	CH ₂ CO ₂ H	Cl	Br	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	I	CH ₂ CO ₂ H	Cl	I	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	Cl	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	Cl	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	Cl	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	Cl	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	Cl	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Cl	MeO	CH ₂ CO ₂ H	Cl	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
Br	Me	CH ₂ CO ₂ H	Br	Me	CH ₂ C(=O)Cl
Br	Et	CH ₂ CO ₂ H	Br	Et	CH ₂ C(=O)Cl
Br	Cl	CH ₂ CO ₂ H	Br	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
Br	Br	CH ₂ CO ₂ H	Br	Br	CH ₂ C(=O)Cl
Br	I	CH ₂ CO ₂ H	Br	I	CH ₂ C(=O)Cl
Br	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	Br	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
Br	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	Br	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Br	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	Br	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
Br	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	Br	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
Br	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	Br	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
Br	MeO	CH ₂ CO ₂ H	Br	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
I	Me	CH ₂ CO ₂ H	I	Me	CH ₂ C(=O)Cl
I	Et	CH ₂ CO ₂ H	I	Et	CH ₂ C(=O)Cl
I	Cl	CH ₂ CO ₂ H	I	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
I	Br	CH ₂ CO ₂ H	I	Br	CH ₂ C(=O)Cl
I	I	CH ₂ CO ₂ H	I	I	CH ₂ C(=O)Cl
I	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	I	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
I	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	I	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
I	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	I	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
I	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	I	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
I	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	I	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
I	MeO	CH ₂ CO ₂ H	I	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	Me	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	Me	CH ₂ C(=O)Cl

R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
CF ₂ H	Et	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	Et	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	Cl	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	Br	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	Br	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	I	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	I	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₂ H	MeO	CH ₂ CO ₂ H	CF ₂ H	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	Me	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	Me	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	Et	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	Et	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	Cl	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	Br	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	Br	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	I	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	I	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃	MeO	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	Me	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	Me	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	Et	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	Et	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	Cl	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	Br	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	Br	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	I	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	I	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CH ₂	MeO	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CH ₂	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	Me	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	Me	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	Et	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	Et	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	Cl	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	Br	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	Br	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	I	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	I	CH ₂ C(=O)Cl

R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
CF ₃ CF ₂	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CF ₃ CF ₂	MeO	CH ₂ CO ₂ H	CF ₃ CF ₂	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	Me	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	Me	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	Et	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	Et	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	Cl	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	Br	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	Br	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	I	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	I	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
CCl ₃	MeO	CH ₂ CO ₂ H	CCl ₃	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	Me	CH ₂ CO ₂ H	MeO	Me	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	Et	CH ₂ CO ₂ H	MeO	Et	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	Cl	CH ₂ CO ₂ H	MeO	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	Br	CH ₂ CO ₂ H	MeO	Br	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	I	CH ₂ CO ₂ H	MeO	I	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	MeO	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	MeO	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	MeO	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	MeO	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	MeO	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
MeO	MeO	CH ₂ CO ₂ H	MeO	MeO	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	Me	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	Me	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	Et	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	Et	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	Cl	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	Cl	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	Br	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	Br	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	I	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	I	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	CF ₂ H	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	CF ₂ H	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	CF ₃	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	CF ₃	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	CF ₃ CH ₂	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	CF ₃ CH ₂	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	CF ₃ CF ₂	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	CF ₃ CF ₂	CH ₂ C(=O)Cl

R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a	R ^{4a1}	R ^{4a2}	A ^a
OCF ₂ H	CCl ₃	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	CCl ₃	CH ₂ C(=O)Cl
OCF ₂ H	MeO	CH ₂ CO ₂ H	OCF ₂ H	MeO	CH ₂ C(=O)Cl

表 7



R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³	R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³
Me	Me	CN	Me	Me	C(=S)NH ₂
Me	Et	CN	Me	Et	C(=S)NH ₂
Me	Cl	CN	Me	Cl	C(=S)NH ₂
Me	Br	CN	Me	Br	C(=S)NH ₂
Me	I	CN	Me	I	C(=S)NH ₂
Me	CF ₂ H	CN	Me	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
Me	CF ₃	CN	Me	CF ₃	C(=S)NH ₂
Me	CF ₃ CH ₂	CN	Me	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
Me	CF ₃ CF ₂	CN	Me	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
Me	CCl ₃	CN	Me	CCl ₃	C(=S)NH ₂
Me	MeO	CN	Me	MeO	C(=S)NH ₂
Et	Me	CN	Et	Me	C(=S)NH ₂
Et	Et	CN	Et	Et	C(=S)NH ₂
Et	Cl	CN	Et	Cl	C(=S)NH ₂
Et	Br	CN	Et	Br	C(=S)NH ₂
Et	I	CN	Et	I	C(=S)NH ₂
Et	CF ₂ H	CN	Et	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
Et	CF ₃	CN	Et	CF ₃	C(=S)NH ₂
Et	CF ₃ CH ₂	CN	Et	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
Et	CF ₃ CF ₂	CN	Et	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
Et	CCl ₃	CN	Et	CCl ₃	C(=S)NH ₂
Et	MeO	CN	Et	MeO	C(=S)NH ₂
Cl	Me	CN	Cl	Me	C(=S)NH ₂
Cl	Et	CN	Cl	Et	C(=S)NH ₂
Cl	Cl	CN	Cl	Cl	C(=S)NH ₂
Cl	Br	CN	Cl	Br	C(=S)NH ₂

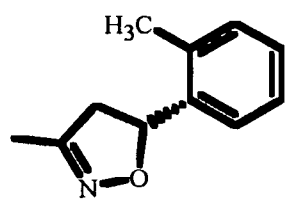
R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³	R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³
Cl	I	CN	Cl	I	C(=S)NH ₂
Cl	CF ₂ H	CN	Cl	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
Cl	CF ₃	CN	Cl	CF ₃	C(=S)NH ₂
Cl	CF ₃ CH ₂	CN	Cl	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
Cl	CF ₃ CF ₂	CN	Cl	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
Cl	CCl ₃	CN	Cl	CCl ₃	C(=S)NH ₂
Cl	MeO	CN	Cl	MeO	C(=S)NH ₂
Br	Me	CN	Br	Me	C(=S)NH ₂
Br	Et	CN	Br	Et	C(=S)NH ₂
Br	Cl	CN	Br	Cl	C(=S)NH ₂
Br	Br	CN	Br	Br	C(=S)NH ₂
Br	I	CN	Br	I	C(=S)NH ₂
Br	CF ₂ H	CN	Br	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
Br	CF ₃	CN	Br	CF ₃	C(=S)NH ₂
Br	CF ₃ CH ₂	CN	Br	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
Br	CF ₃ CF ₂	CN	Br	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
Br	CCl ₃	CN	Br	CCl ₃	C(=S)NH ₂
Br	MeO	CN	Br	MeO	C(=S)NH ₂
I	Me	CN	I	Me	C(=S)NH ₂
I	Et	CN	I	Et	C(=S)NH ₂
I	Cl	CN	I	Cl	C(=S)NH ₂
I	Br	CN	I	Br	C(=S)NH ₂
I	I	CN	I	I	C(=S)NH ₂
I	CF ₂ H	CN	I	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
I	CF ₃	CN	I	CF ₃	C(=S)NH ₂
I	CF ₃ CH ₂	CN	I	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
I	CF ₃ CF ₂	CN	I	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
I	CCl ₃	CN	I	CCl ₃	C(=S)NH ₂
I	MeO	CN	I	MeO	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	Me	CN	CF ₂ H	Me	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	Et	CN	CF ₂ H	Et	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	Cl	CN	CF ₂ H	Cl	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	Br	CN	CF ₂ H	Br	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	I	CN	CF ₂ H	I	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	CF ₂ H	CN	CF ₂ H	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	CF ₃	CN	CF ₂ H	CF ₃	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	CF ₃ CH ₂	CN	CF ₂ H	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂

R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³	R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³
CF ₂ H	CF ₃ CF ₂	CN	CF ₂ H	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	CCl ₃	CN	CF ₂ H	CCl ₃	C(=S)NH ₂
CF ₂ H	MeO	CN	CF ₂ H	MeO	C(=S)NH ₂
CF ₃	Me	CN	CF ₃	Me	C(=S)NH ₂
CF ₃	Et	CN	CF ₃	Et	C(=S)NH ₂
CF ₃	Cl	CN	CF ₃	Cl	C(=S)NH ₂
CF ₃	Br	CN	CF ₃	Br	C(=S)NH ₂
CF ₃	I	CN	CF ₃	I	C(=S)NH ₂
CF ₃	CF ₂ H	CN	CF ₃	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
CF ₃	CF ₃	CN	CF ₃	CF ₃	C(=S)NH ₂
CF ₃	CF ₃ CH ₂	CN	CF ₃	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
CF ₃	CF ₃ CF ₂	CN	CF ₃	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
CF ₃	CCl ₃	CN	CF ₃	CCl ₃	C(=S)NH ₂
CF ₃	MeO	CN	CF ₃	MeO	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	Me	CN	CF ₃ CH ₂	Me	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	Et	CN	CF ₃ CH ₂	Et	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	Cl	CN	CF ₃ CH ₂	Cl	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	Br	CN	CF ₃ CH ₂	Br	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	I	CN	CF ₃ CH ₂	I	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	CF ₂ H	CN	CF ₃ CH ₂	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	CF ₃	CN	CF ₃ CH ₂	CF ₃	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	CF ₃ CH ₂	CN	CF ₃ CH ₂	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	CF ₃ CF ₂	CN	CF ₃ CH ₂	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	CCl ₃	CN	CF ₃ CH ₂	CCl ₃	C(=S)NH ₂
CF ₃ CH ₂	MeO	CN	CF ₃ CH ₂	MeO	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	Me	CN	CF ₃ CF ₂	Me	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	Et	CN	CF ₃ CF ₂	Et	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	Cl	CN	CF ₃ CF ₂	Cl	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	Br	CN	CF ₃ CF ₂	Br	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	I	CN	CF ₃ CF ₂	I	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	CF ₂ H	CN	CF ₃ CF ₂	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	CF ₃	CN	CF ₃ CF ₂	CF ₃	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	CF ₃ CH ₂	CN	CF ₃ CF ₂	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	CF ₃ CF ₂	CN	CF ₃ CF ₂	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	CCl ₃	CN	CF ₃ CF ₂	CCl ₃	C(=S)NH ₂
CF ₃ CF ₂	MeO	CN	CF ₃ CF ₂	MeO	C(=S)NH ₂
CCl ₃	Me	CN	CCl ₃	Me	C(=S)NH ₂

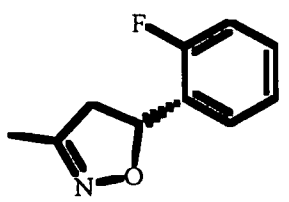
R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³	R ^{4a1}	R ^{4a2}	Z ³
CCl ₃	Et	CN	CCl ₃	Et	C(=S)NH ₂
CCl ₃	Cl	CN	CCl ₃	Cl	C(=S)NH ₂
CCl ₃	Br	CN	CCl ₃	Br	C(=S)NH ₂
CCl ₃	I	CN	CCl ₃	I	C(=S)NH ₂
CCl ₃	CF ₂ H	CN	CCl ₃	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
CCl ₃	CF ₃	CN	CCl ₃	CF ₃	C(=S)NH ₂
CCl ₃	CF ₃ CH ₂	CN	CCl ₃	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
CCl ₃	CF ₃ CF ₂	CN	CCl ₃	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
CCl ₃	CCl ₃	CN	CCl ₃	CCl ₃	C(=S)NH ₂
CCl ₃	MeO	CN	CCl ₃	MeO	C(=S)NH ₂
MeO	Me	CN	MeO	Me	C(=S)NH ₂
MeO	Et	CN	MeO	Et	C(=S)NH ₂
MeO	Cl	CN	MeO	Cl	C(=S)NH ₂
MeO	Br	CN	MeO	Br	C(=S)NH ₂
MeO	I	CN	MeO	I	C(=S)NH ₂
MeO	CF ₂ H	CN	MeO	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
MeO	CF ₃	CN	MeO	CF ₃	C(=S)NH ₂
MeO	CF ₃ CH ₂	CN	MeO	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
MeO	CF ₃ CF ₂	CN	MeO	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
MeO	CCl ₃	CN	MeO	CCl ₃	C(=S)NH ₂
MeO	MeO	CN	MeO	MeO	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	Me	CN	OCF ₂ H	Me	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	Et	CN	OCF ₂ H	Et	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	Cl	CN	OCF ₂ H	Cl	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	Br	CN	OCF ₂ H	Br	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	I	CN	OCF ₂ H	I	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	CF ₂ H	CN	OCF ₂ H	CF ₂ H	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	CF ₃	CN	OCF ₂ H	CF ₃	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	CF ₃ CH ₂	CN	OCF ₂ H	CF ₃ CH ₂	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	CF ₃ CF ₂	CN	OCF ₂ H	CF ₃ CF ₂	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	CCl ₃	CN	OCF ₂ H	CCl ₃	C(=S)NH ₂
OCF ₂ H	MeO	CN	OCF ₂ H	MeO	C(=S)NH ₂



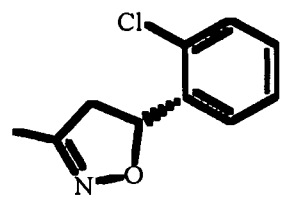
其中，J¹ 為



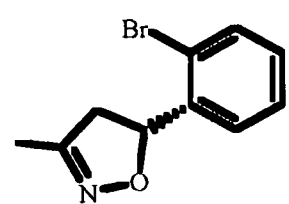
J-29-1



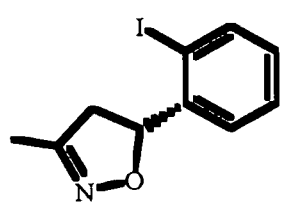
J-29-2



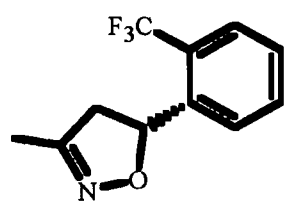
J-29-3



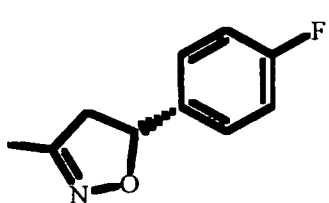
J-29-4



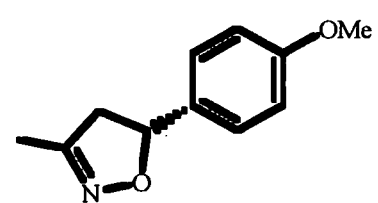
J-29-5



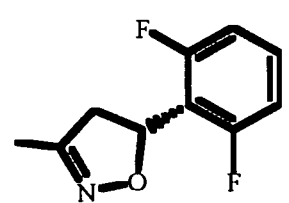
J-29-6



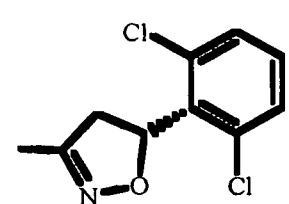
J-29-7



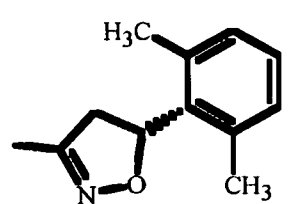
J-29-8



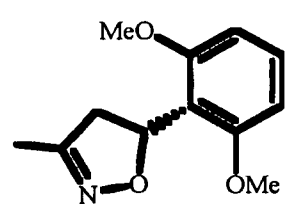
J-29-9



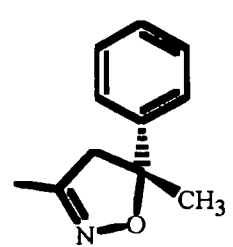
J-29-10



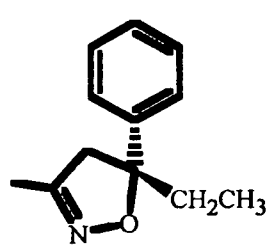
J-29-11



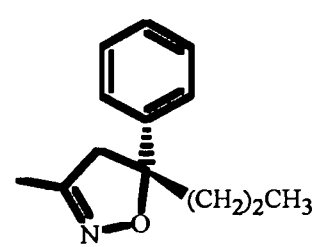
J-29-12



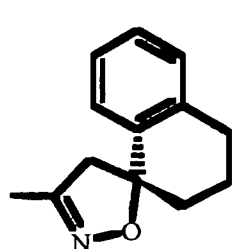
J-29-13



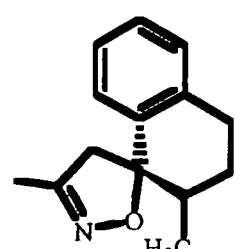
J-29-14



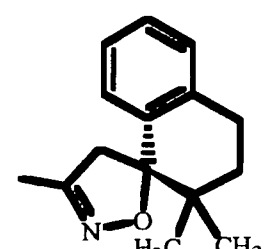
J-29-15



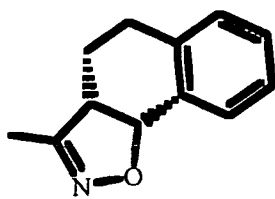
J-29-16



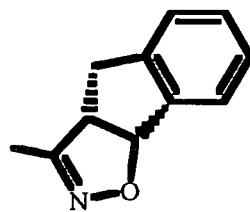
J-29-17



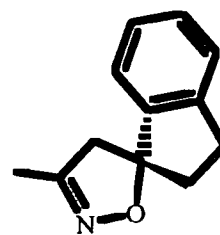
J-29-18



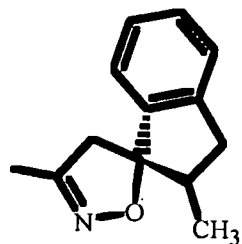
J-29-19



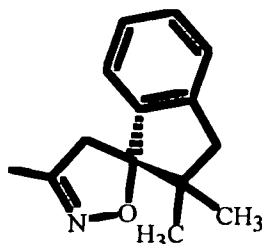
J-29-20



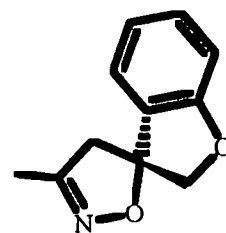
J-29-21



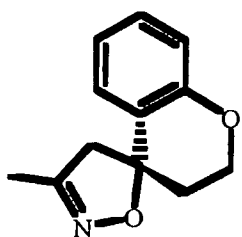
J-29-22



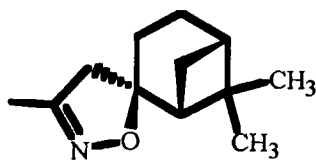
J-29-23



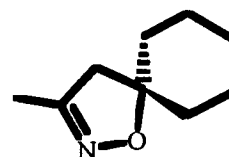
J-29-24



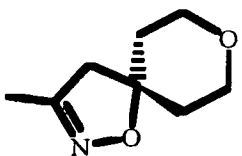
J-29-25



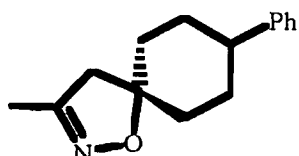
J-29-26



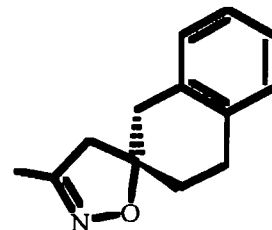
J-29-27



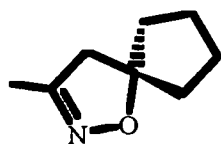
J-29-28



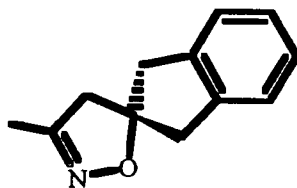
J-29-29



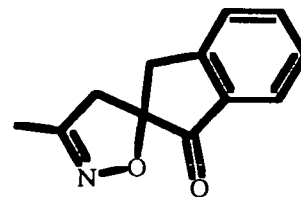
J-29-30



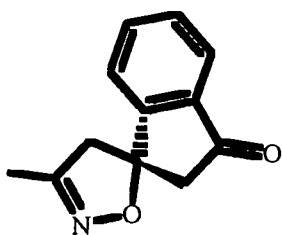
J-29-31



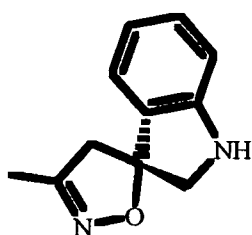
J-29-32



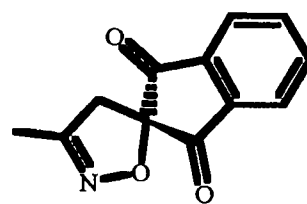
J-29-33



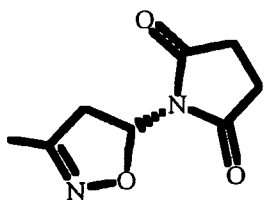
J-29-34



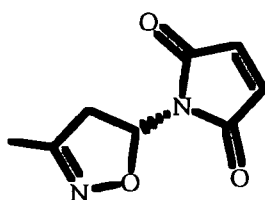
J-29-35



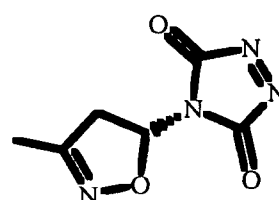
J-29-36



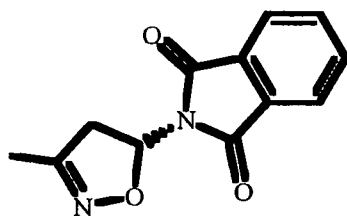
J-29-37



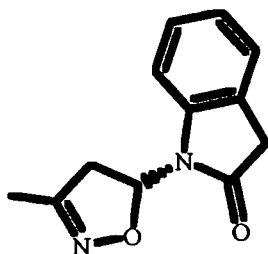
J-29-38



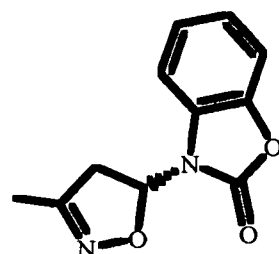
J-29-39



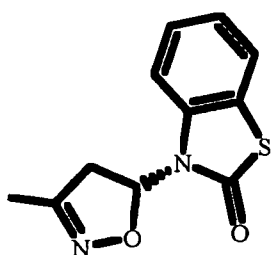
J-29-40



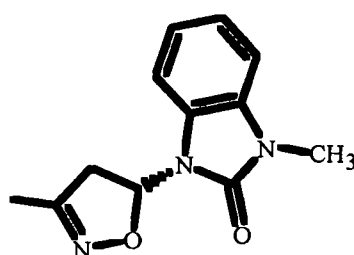
J-29-41



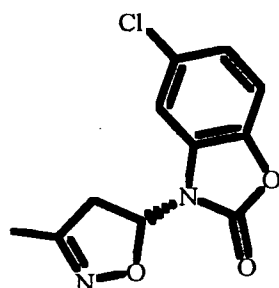
J-29-42



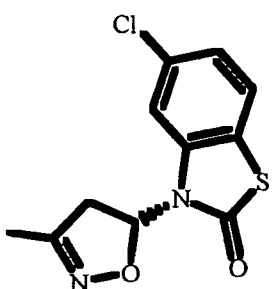
J-29-43



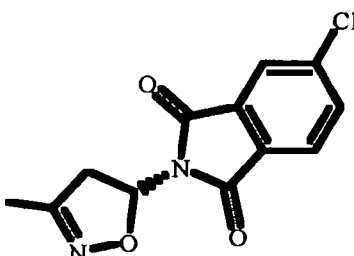
J-29-44



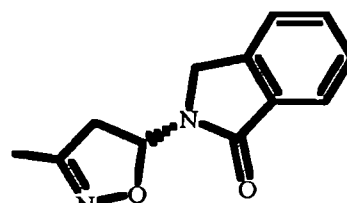
J-29-45



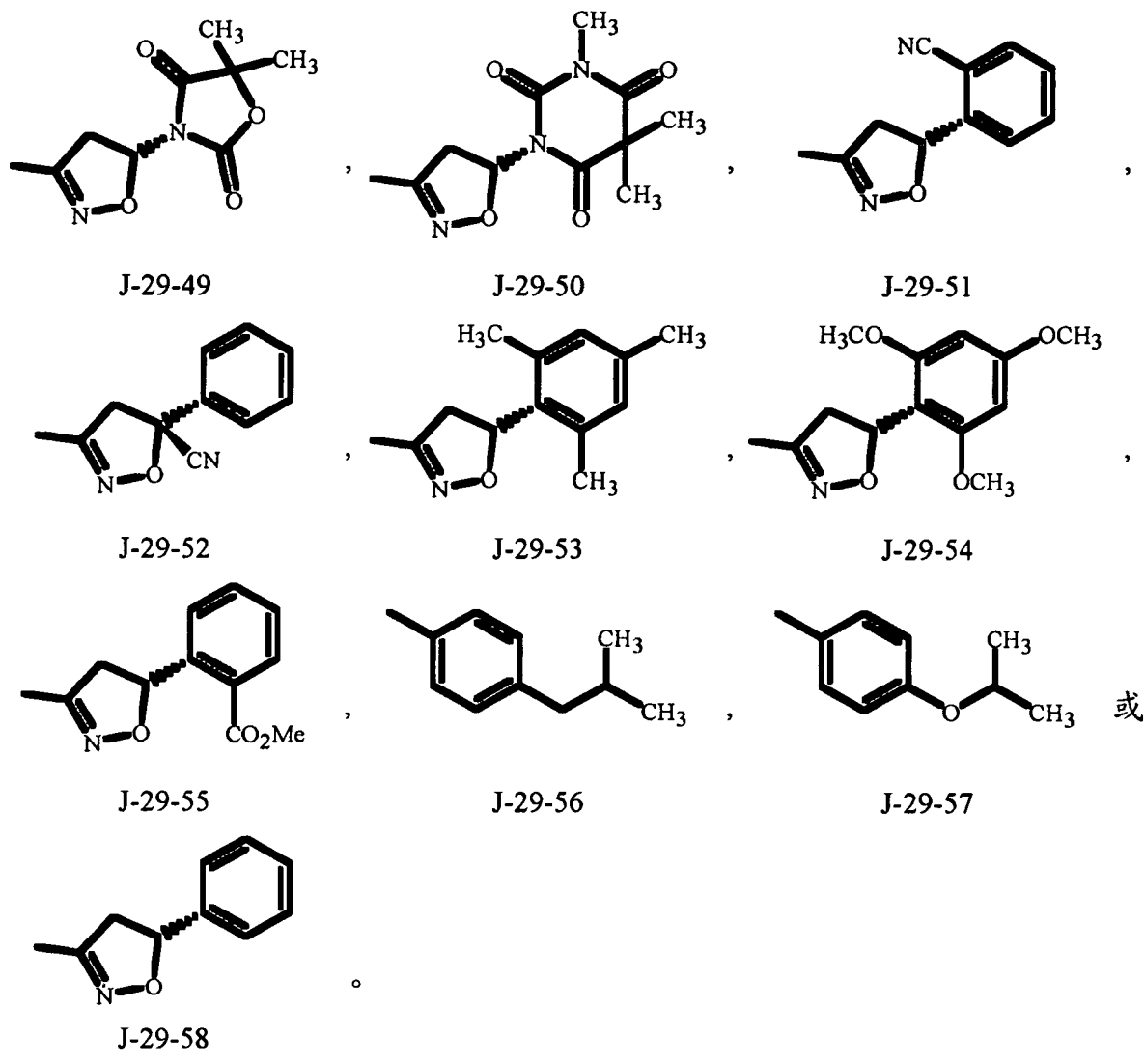
J-29-46



J-29-47



J-29-48



M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
CH ₃	J-29-1	NMe ₂	J-29-1	OMe	J-29-2
CH ₂ Cl	J-29-1	NEt ₂	J-29-1	OEt	J-29-2
CH ₂ Br	J-29-1	N(n-Pr) ₂	J-29-1	OPr	J-29-2
CH ₂ I	J-29-1	1-六氢吡啶基	J-29-1	O-i-Pr	J-29-2
OH	J-29-1	1-四氢吡咯基	J-29-1	O-n-Bu	J-29-2
OMe	J-29-1	4-吗福啉基	J-29-1	O-t-Bu	J-29-2
OEt	J-29-1	CH ₃	J-29-2	NMe ₂	J-29-2
OPr	J-29-1	CH ₂ Cl	J-29-2	NEt ₂	J-29-2
O-i-Pr	J-29-1	CH ₂ Br	J-29-2	N(n-Pr) ₂	J-29-2
O-n-Bu	J-29-1	CH ₂ I	J-29-2	1-六氢吡啶基	J-29-2
O-t-Bu	J-29-1	OH	J-29-2	1-四氢吡咯基	J-29-2

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
4-嗎福啉基	J-29-2	CH ₂ Br	J-29-5	OMe	J-29-7
CH ₃	J-29-3	CH ₂ I	J-29-5	OEt	J-29-7
CH ₂ Cl	J-29-3	OH	J-29-5	OPr	J-29-7
CH ₂ Br	J-29-3	OMe	J-29-5	O-i-Pr	J-29-7
CH ₂ I	J-29-3	OEt	J-29-5	O-n-Bu	J-29-7
OH	J-29-3	OPr	J-29-5	O-t-Bu	J-29-7
OMe	J-29-3	O-i-Pr	J-29-5	NMe ₂	J-29-7
OEt	J-29-3	O-n-Bu	J-29-5	NEt ₂	J-29-7
OPr	J-29-3	O-t-Bu	J-29-5	N(n-Pr) ₂	J-29-7
O-i-Pr	J-29-3	NMe ₂	J-29-5	1-六氫吡啶基	J-29-7
O-n-Bu	J-29-3	NEt ₂	J-29-5	1-四氫吡咯基	J-29-7
O-t-Bu	J-29-3	N(n-Pr) ₂	J-29-5	4-嗎福啉基	J-29-7
NMe ₂	J-29-3	1-六氫吡啶基	J-29-5	CH ₃	J-29-8
NEt ₂	J-29-3	1-四氫吡咯基	J-29-5	CH ₂ Cl	J-29-8
N(n-Pr) ₂	J-29-3	4-嗎福啉基	J-29-5	CH ₂ Br	J-29-8
1-六氫吡啶基	J-29-3	CH ₃	J-29-6	CH ₂ I	J-29-8
1-四氫吡咯基	J-29-3	CH ₂ Cl	J-29-6	OH	J-29-8
4-嗎福啉基	J-29-3	CH ₂ Br	J-29-6	OMe	J-29-8
CH ₃	J-29-4	CH ₂ I	J-29-6	OEt	J-29-8
CH ₂ Cl	J-29-4	OH	J-29-6	OPr	J-29-8
CH ₂ Br	J-29-4	OMe	J-29-6	O-i-Pr	J-29-8
CH ₂ I	J-29-4	OEt	J-29-6	O-n-Bu	J-29-8
OH	J-29-4	OPr	J-29-6	O-t-Bu	J-29-8
OMe	J-29-4	O-i-Pr	J-29-6	NMe ₂	J-29-8
OEt	J-29-4	O-n-Bu	J-29-6	NEt ₂	J-29-8
OPr	J-29-4	O-t-Bu	J-29-6	N(n-Pr) ₂	J-29-8
O-i-Pr	J-29-4	NMe ₂	J-29-6	1-六氫吡啶基	J-29-8
O-n-Bu	J-29-4	NEt ₂	J-29-6	1-四氫吡咯基	J-29-8
O-t-Bu	J-29-4	N(n-Pr) ₂	J-29-6	4-嗎福啉基	J-29-8
NMe ₂	J-29-4	1-六氫吡啶基	J-29-6	CH ₃	J-29-9
NEt ₂	J-29-4	1-四氫吡咯基	J-29-6	CH ₂ Cl	J-29-9
N(n-Pr) ₂	J-29-4	4-嗎福啉基	J-29-6	CH ₂ Br	J-29-9
1-六氫吡啶基	J-29-4	CH ₃	J-29-7	CH ₂ I	J-29-9
1-四氫吡咯基	J-29-4	CH ₂ Cl	J-29-7	OH	J-29-9
4-嗎福啉基	J-29-4	CH ₂ Br	J-29-7	OMe	J-29-9
CH ₃	J-29-5	CH ₂ I	J-29-7	OEt	J-29-9
CH ₂ Cl	J-29-5	OH	J-29-7	OPr	J-29-9

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
O-i-Pr	J-29-9	NMe ₂	J-29-11	1-六氫吡啶基	J-29-13
O-n-Bu	J-29-9	NEt ₂	J-29-11	1-四氫吡咯基	J-29-13
O-t-Bu	J-29-9	N(n-Pr) ₂	J-29-11	4-嗎福啉基	J-29-13
NMe ₂	J-29-9	1-六氫吡啶基	J-29-11	CH ₃	J-29-14
NEt ₂	J-29-9	1-四氫吡咯基	J-29-11	CH ₂ Cl	J-29-14
N(n-Pr) ₂	J-29-9	4-嗎福啉基	J-29-11	CH ₂ Br	J-29-14
1-六氫吡啶基	J-29-9	CH ₃	J-29-12	CH ₂ I	J-29-14
1-四氫吡咯基	J-29-9	CH ₂ Cl	J-29-12	OH	J-29-14
4-嗎福啉基	J-29-9	CH ₂ Br	J-29-12	OMe	J-29-14
CH ₃	J-29-10	CH ₂ I	J-29-12	OEt	J-29-14
CH ₂ Cl	J-29-10	OH	J-29-12	OPr	J-29-14
CH ₂ Br	J-29-10	OMe	J-29-12	O-i-Pr	J-29-14
CH ₂ I	J-29-10	OEt	J-29-12	O-n-Bu	J-29-14
OH	J-29-10	OPr	J-29-12	O-t-Bu	J-29-14
OMe	J-29-10	O-i-Pr	J-29-12	NMe ₂	J-29-14
OEt	J-29-10	O-n-Bu	J-29-12	NEt ₂	J-29-14
OPr	J-29-10	O-t-Bu	J-29-12	N(n-Pr) ₂	J-29-14
O-i-Pr	J-29-10	NMe ₂	J-29-12	1-六氫吡啶基	J-29-14
O-n-Bu	J-29-10	NEt ₂	J-29-12	1-四氫吡咯基	J-29-14
O-t-Bu	J-29-10	N(n-Pr) ₂	J-29-12	4-嗎福啉基	J-29-14
NMe ₂	J-29-10	1-六氫吡啶基	J-29-12	CH ₃	J-29-15
NEt ₂	J-29-10	1-四氫吡咯基	J-29-12	CH ₂ Cl	J-29-15
N(n-Pr) ₂	J-29-10	4-嗎福啉基	J-29-12	CH ₂ Br	J-29-15
1-六氫吡啶基	J-29-10	CH ₃	J-29-13	CH ₂ I	J-29-15
1-四氫吡咯基	J-29-10	CH ₂ Cl	J-29-13	OH	J-29-15
4-嗎福啉基	J-29-10	CH ₂ Br	J-29-13	OMe	J-29-15
CH ₃	J-29-11	CH ₂ I	J-29-13	OEt	J-29-15
CH ₂ Cl	J-29-11	OH	J-29-13	OPr	J-29-15
CH ₂ Br	J-29-11	OMe	J-29-13	O-i-Pr	J-29-15
CH ₂ I	J-29-11	OEt	J-29-13	O-n-Bu	J-29-15
OH	J-29-11	OPr	J-29-13	O-t-Bu	J-29-15
OMe	J-29-11	O-i-Pr	J-29-13	NMe ₂	J-29-15
OEt	J-29-11	O-n-Bu	J-29-13	NEt ₂	J-29-15
OPr	J-29-11	O-t-Bu	J-29-13	N(n-Pr) ₂	J-29-15
O-i-Pr	J-29-11	NMe ₂	J-29-13	1-六氫吡啶基	J-29-15
O-n-Bu	J-29-11	NEt ₂	J-29-13	1-四氫吡咯基	J-29-15
O-t-Bu	J-29-11	N(n-Pr) ₂	J-29-13	4-嗎福啉基	J-29-15

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
CH ₃	J-29-16	CH ₂ I	J-29-18	OEt	J-29-20
CH ₂ Cl	J-29-16	OH	J-29-18	OPr	J-29-20
CH ₂ Br	J-29-16	OMe	J-29-18	O-i-Pr	J-29-20
CH ₂ I	J-29-16	OEt	J-29-18	O-n-Bu	J-29-20
OH	J-29-16	OPr	J-29-18	O-t-Bu	J-29-20
OMe	J-29-16	O-i-Pr	J-29-18	NMe ₂	J-29-20
OEt	J-29-16	O-n-Bu	J-29-18	NEt ₂	J-29-20
OPr	J-29-16	O-t-Bu	J-29-18	N(n-Pr) ₂	J-29-20
O-i-Pr	J-29-16	NMe ₂	J-29-18	1-六氫吡啶基	J-29-20
O-n-Bu	J-29-16	NEt ₂	J-29-18	1-四氫吡咯基	J-29-20
O-t-Bu	J-29-16	N(n-Pr) ₂	J-29-18	4-嗎福啉基	J-29-20
NMe ₂	J-29-16	1-六氫吡啶基	J-29-18	CH ₃	J-29-21
NEt ₂	J-29-16	1-四氫吡咯基	J-29-18	CH ₂ Cl	J-29-21
N(n-Pr) ₂	J-29-16	4-嗎福啉基	J-29-18	CH ₂ Br	J-29-21
1-六氫吡啶基	J-29-16	CH ₃	J-29-19	CH ₂ I	J-29-21
1-四氫吡咯基	J-29-16	CH ₂ Cl	J-29-19	OH	J-29-21
4-嗎福啉基	J-29-16	CH ₂ Br	J-29-19	OMe	J-29-21
CH ₃	J-29-17	CH ₂ I	J-29-19	OEt	J-29-21
CH ₂ Cl	J-29-17	OH	J-29-19	OPr	J-29-21
CH ₂ Br	J-29-17	OMe	J-29-19	O-i-Pr	J-29-21
CH ₂ I	J-29-17	OEt	J-29-19	O-n-Bu	J-29-21
OH	J-29-17	OPr	J-29-19	O-t-Bu	J-29-21
OMe	J-29-17	O-i-Pr	J-29-19	NMe ₂	J-29-21
OEt	J-29-17	O-n-Bu	J-29-19	NEt ₂	J-29-21
OPr	J-29-17	O-t-Bu	J-29-19	N(n-Pr) ₂	J-29-21
O-i-Pr	J-29-17	NMe ₂	J-29-19	1-六氫吡啶基	J-29-21
O-n-Bu	J-29-17	NEt ₂	J-29-19	1-四氫吡咯基	J-29-21
O-t-Bu	J-29-17	N(n-Pr) ₂	J-29-19	4-嗎福啉基	J-29-21
NMe ₂	J-29-17	1-六氫吡啶基	J-29-19	CH ₃	J-29-22
NEt ₂	J-29-17	1-四氫吡咯基	J-29-19	CH ₂ Cl	J-29-22
N(n-Pr) ₂	J-29-17	4-嗎福啉基	J-29-19	CH ₂ Br	J-29-22
1-六氫吡啶基	J-29-17	CH ₃	J-29-20	CH ₂ I	J-29-22
1-四氫吡咯基	J-29-17	CH ₂ Cl	J-29-20	OH	J-29-22
4-嗎福啉基	J-29-17	CH ₂ Br	J-29-20	OMe	J-29-22
CH ₃	J-29-18	CH ₂ I	J-29-20	OEt	J-29-22
CH ₂ Cl	J-29-18	OH	J-29-20	OPr	J-29-22
CH ₂ Br	J-29-18	OMe	J-29-20	O-i-Pr	J-29-22

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
O-n-Bu	J-29-22	NEt ₂	J-29-24	1-四氫吡咯基	J-29-26
O-t-Bu	J-29-22	N(n-Pr) ₂	J-29-24	4-嗎福啉基	J-29-26
NMe ₂	J-29-22	1-六氫吡啶基	J-29-24	CH ₃	J-29-27
NEt ₂	J-29-22	1-四氫吡咯基	J-29-24	CH ₂ Cl	J-29-27
N(n-Pr) ₂	J-29-22	4-嗎福啉基	J-29-24	CH ₂ Br	J-29-27
1-六氫吡啶基	J-29-22	CH ₃	J-29-25	CH ₂ I	J-29-27
1-四氫吡咯基	J-29-22	CH ₂ Cl	J-29-25	OH	J-29-27
4-嗎福啉基	J-29-22	CH ₂ Br	J-29-25	OMe	J-29-27
CH ₃	J-29-23	CH ₂ I	J-29-25	OEt	J-29-27
CH ₂ Cl	J-29-23	OH	J-29-25	OPr	J-29-27
CH ₂ Br	J-29-23	OMe	J-29-25	O-i-Pr	J-29-27
CH ₂ I	J-29-23	OEt	J-29-25	O-n-Bu	J-29-27
OH	J-29-23	OPr	J-29-25	O-t-Bu	J-29-27
OMe	J-29-23	O-i-Pr	J-29-25	NMe ₂	J-29-27
OEt	J-29-23	O-n-Bu	J-29-25	NEt ₂	J-29-27
OPr	J-29-23	O-t-Bu	J-29-25	N(n-Pr) ₂	J-29-27
O-i-Pr	J-29-23	NMe ₂	J-29-25	1-六氫吡啶基	J-29-27
O-n-Bu	J-29-23	NEt ₂	J-29-25	1-四氫吡咯基	J-29-27
O-t-Bu	J-29-23	N(n-Pr) ₂	J-29-25	4-嗎福啉基	J-29-27
NMe ₂	J-29-23	1-六氫吡啶基	J-29-25	CH ₃	J-29-28
NEt ₂	J-29-23	1-四氫吡咯基	J-29-25	CH ₂ Cl	J-29-28
N(n-Pr) ₂	J-29-23	4-嗎福啉基	J-29-25	CH ₂ Br	J-29-28
1-六氫吡啶基	J-29-23	CH ₃	J-29-26	CH ₂ I	J-29-28
1-四氫吡咯基	J-29-23	CH ₂ Cl	J-29-26	OH	J-29-28
4-嗎福啉基	J-29-23	CH ₂ Br	J-29-26	OMe	J-29-28
CH ₃	J-29-24	CH ₂ I	J-29-26	OEt	J-29-28
CH ₂ Cl	J-29-24	OH	J-29-26	OPr	J-29-28
CH ₂ Br	J-29-24	OMe	J-29-26	O-i-Pr	J-29-28
CH ₂ I	J-29-24	OEt	J-29-26	O-n-Bu	J-29-28
OH	J-29-24	OPr	J-29-26	O-t-Bu	J-29-28
OMe	J-29-24	O-i-Pr	J-29-26	NMe ₂	J-29-28
OEt	J-29-24	O-n-Bu	J-29-26	NEt ₂	J-29-28
OPr	J-29-24	O-t-Bu	J-29-26	N(n-Pr) ₂	J-29-28
O-i-Pr	J-29-24	NMe ₂	J-29-26	1-六氫吡啶基	J-29-28
O-n-Bu	J-29-24	NEt ₂	J-29-26	1-四氫吡咯基	J-29-28
O-t-Bu	J-29-24	N(n-Pr) ₂	J-29-26	4-嗎福啉基	J-29-28
NMe ₂	J-29-24	1-六氫吡啶基	J-29-26	CH ₃	J-29-29

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
CH ₂ Cl	J-29-29	OH	J-29-31	OPr	J-29-33
CH ₂ Br	J-29-29	OMe	J-29-31	O-i-Pr	J-29-33
CH ₂ I	J-29-29	OEt	J-29-31	O-n-Bu	J-29-33
OH	J-29-29	OPr	J-29-31	O-t-Bu	J-29-33
OMe	J-29-29	O-i-Pr	J-29-31	NMe ₂	J-29-33
OEt	J-29-29	O-n-Bu	J-29-31	NEt ₂	J-29-33
OPr	J-29-29	O-t-Bu	J-29-31	N(n-Pr) ₂	J-29-33
O-i-Pr	J-29-29	NMe ₂	J-29-31	1-六氫吡啶基	J-29-33
O-n-Bu	J-29-29	NEt ₂	J-29-31	1-四氫吡咯基	J-29-33
O-t-Bu	J-29-29	N(n-Pr) ₂	J-29-31	4-嗎福啉基	J-29-33
NMe ₂	J-29-29	1-六氫吡啶基	J-29-31	CH ₃	J-29-34
NEt ₂	J-29-29	1-四氫吡咯基	J-29-31	CH ₂ Cl	J-29-34
N(n-Pr) ₂	J-29-29	4-嗎福啉基	J-29-31	CH ₂ Br	J-29-34
1-六氫吡啶基	J-29-29	CH ₃	J-29-32	CH ₂ I	J-29-34
1-四氫吡咯基	J-29-29	CH ₂ Cl	J-29-32	OH	J-29-34
4-嗎福啉基	J-29-29	CH ₂ Br	J-29-32	OMe	J-29-34
CH ₃	J-29-30	CH ₂ I	J-29-32	OEt	J-29-34
CH ₂ Cl	J-29-30	OH	J-29-32	OPr	J-29-34
CH ₂ Br	J-29-30	OMe	J-29-32	O-i-Pr	J-29-34
CH ₂ I	J-29-30	OEt	J-29-32	O-n-Bu	J-29-34
OH	J-29-30	OPr	J-29-32	O-t-Bu	J-29-34
OMe	J-29-30	O-i-Pr	J-29-32	NMe ₂	J-29-34
OEt	J-29-30	O-n-Bu	J-29-32	NEt ₂	J-29-34
OPr	J-29-30	O-t-Bu	J-29-32	N(n-Pr) ₂	J-29-34
O-i-Pr	J-29-30	NMe ₂	J-29-32	1-六氫吡啶基	J-29-34
O-n-Bu	J-29-30	NEt ₂	J-29-32	1-四氫吡咯基	J-29-34
O-t-Bu	J-29-30	N(n-Pr) ₂	J-29-32	4-嗎福啉基	J-29-34
NMe ₂	J-29-30	1-六氫吡啶基	J-29-32	CH ₃	J-29-35
NEt ₂	J-29-30	1-四氫吡咯基	J-29-32	CH ₂ Cl	J-29-35
N(n-Pr) ₂	J-29-30	4-嗎福啉基	J-29-32	CH ₂ Br	J-29-35
1-六氫吡啶基	J-29-30	CH ₃	J-29-33	CH ₂ I	J-29-35
1-四氫吡咯基	J-29-30	CH ₂ Cl	J-29-33	OH	J-29-35
4-嗎福啉基	J-29-30	CH ₂ Br	J-29-33	OMe	J-29-35
CH ₃	J-29-31	CH ₂ I	J-29-33	OEt	J-29-35
CH ₂ Cl	J-29-31	OH	J-29-33	OPr	J-29-35
CH ₂ Br	J-29-31	OMe	J-29-33	O-i-Pr	J-29-35
CH ₂ I	J-29-31	OEt	J-29-33	O-n-Bu	J-29-35

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
O-t-Bu	J-29-35	N(n-Pr) ₂	J-29-37	4-嗎福啉基	J-29-39
NMe ₂	J-29-35	1-六氫吡啶基	J-29-37	CH ₃	J-29-40
NEt ₂	J-29-35	1-四氫吡咯基	J-29-37	CH ₂ Cl	J-29-40
N(n-Pr) ₂	J-29-35	4-嗎福啉基	J-29-37	CH ₂ Br	J-29-40
1-六氫吡啶基	J-29-35	CH ₃	J-29-38	CH ₂ I	J-29-40
1-四氫吡咯基	J-29-35	CH ₂ Cl	J-29-38	OH	J-29-40
4-嗎福啉基	J-29-35	CH ₂ Br	J-29-38	OMe	J-29-40
CH ₃	J-29-36	CH ₂ I	J-29-38	OEt	J-29-40
CH ₂ Cl	J-29-36	OH	J-29-38	OPr	J-29-40
CH ₂ Br	J-29-36	OMe	J-29-38	O-i-Pr	J-29-40
CH ₂ I	J-29-36	OEt	J-29-38	O-n-Bu	J-29-40
OH	J-29-36	OPr	J-29-38	O-t-Bu	J-29-40
OMe	J-29-36	O-i-Pr	J-29-38	NMe ₂	J-29-40
OEt	J-29-36	O-n-Bu	J-29-38	NEt ₂	J-29-40
OPr	J-29-36	O-t-Bu	J-29-38	N(n-Pr) ₂	J-29-40
O-i-Pr	J-29-36	NMe ₂	J-29-38	1-六氫吡啶基	J-29-40
O-n-Bu	J-29-36	NEt ₂	J-29-38	1-四氫吡咯基	J-29-40
O-t-Bu	J-29-36	N(n-Pr) ₂	J-29-38	4-嗎福啉基	J-29-40
NMe ₂	J-29-36	1-六氫吡啶基	J-29-38	CH ₃	J-29-41
NEt ₂	J-29-36	1-四氫吡咯基	J-29-38	CH ₂ Cl	J-29-41
N(n-Pr) ₂	J-29-36	4-嗎福啉基	J-29-38	CH ₂ Br	J-29-41
1-六氫吡啶基	J-29-36	CH ₃	J-29-39	CH ₂ I	J-29-41
1-四氫吡咯基	J-29-36	CH ₂ Cl	J-29-39	OH	J-29-41
4-嗎福啉基	J-29-36	CH ₂ Br	J-29-39	OMe	J-29-41
CH ₃	J-29-37	CH ₂ I	J-29-39	OEt	J-29-41
CH ₂ Cl	J-29-37	OH	J-29-39	OPr	J-29-41
CH ₂ Br	J-29-37	OMe	J-29-39	O-i-Pr	J-29-41
CH ₂ I	J-29-37	OEt	J-29-39	O-n-Bu	J-29-41
OH	J-29-37	OPr	J-29-39	O-t-Bu	J-29-41
OMe	J-29-37	O-i-Pr	J-29-39	NMe ₂	J-29-41
OEt	J-29-37	O-n-Bu	J-29-39	NEt ₂	J-29-41
OPr	J-29-37	O-t-Bu	J-29-39	N(n-Pr) ₂	J-29-41
O-i-Pr	J-29-37	NMe ₂	J-29-39	1-六氫吡啶基	J-29-41
O-n-Bu	J-29-37	NEt ₂	J-29-39	1-四氫吡咯基	J-29-41
O-t-Bu	J-29-37	N(n-Pr) ₂	J-29-39	4-嗎福啉基	J-29-41
NMe ₂	J-29-37	1-六氫吡啶基	J-29-39	CH ₃	J-29-42
NEt ₂	J-29-37	1-四氫吡咯基	J-29-39	CH ₂ Cl	J-29-42

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
CH ₂ Br	J-29-42	OMe	J-29-44	O-i-Pr	J-29-46
CH ₂ I	J-29-42	OEt	J-29-44	O-n-Bu	J-29-46
OH	J-29-42	OPr	J-29-44	O-t-Bu	J-29-46
OMe	J-29-42	O-i-Pr	J-29-44	NMe ₂	J-29-46
OEt	J-29-42	O-n-Bu	J-29-44	NEt ₂	J-29-46
OPr	J-29-42	O-t-Bu	J-29-44	N(n-Pr) ₂	J-29-46
O-i-Pr	J-29-42	NMe ₂	J-29-44	1-六氫吡啶基	J-29-46
O-n-Bu	J-29-42	NEt ₂	J-29-44	1-四氫吡咯基	J-29-46
O-t-Bu	J-29-42	N(n-Pr) ₂	J-29-44	4-嗎福啉基	J-29-46
NMe ₂	J-29-42	1-六氫吡啶基	J-29-44	CH ₃	J-29-47
NEt ₂	J-29-42	1-四氫吡咯基	J-29-44	CH ₂ Cl	J-29-47
N(n-Pr) ₂	J-29-42	4-嗎福啉基	J-29-44	CH ₂ Br	J-29-47
1-六氫吡啶基	J-29-42	CH ₃	J-29-45	CH ₂ I	J-29-47
1-四氫吡咯基	J-29-42	CH ₂ Cl	J-29-45	OH	J-29-47
4-嗎福啉基	J-29-42	CH ₂ Br	J-29-45	OMe	J-29-47
CH ₃	J-29-43	CH ₂ I	J-29-45	OEt	J-29-47
CH ₂ Cl	J-29-43	OH	J-29-45	OPr	J-29-47
CH ₂ Br	J-29-43	OMe	J-29-45	O-i-Pr	J-29-47
CH ₂ I	J-29-43	OEt	J-29-45	O-n-Bu	J-29-47
OH	J-29-43	OPr	J-29-45	O-t-Bu	J-29-47
OMe	J-29-43	O-i-Pr	J-29-45	NMe ₂	J-29-47
OEt	J-29-43	O-n-Bu	J-29-45	NEt ₂	J-29-47
OPr	J-29-43	O-t-Bu	J-29-45	N(n-Pr) ₂	J-29-47
O-i-Pr	J-29-43	NMe ₂	J-29-45	1-六氫吡啶基	J-29-47
O-n-Bu	J-29-43	NEt ₂	J-29-45	1-四氫吡咯基	J-29-47
O-t-Bu	J-29-43	N(n-Pr) ₂	J-29-45	4-嗎福啉基	J-29-47
NMe ₂	J-29-43	1-六氫吡啶基	J-29-45	CH ₃	J-29-48
NEt ₂	J-29-43	1-四氫吡咯基	J-29-45	CH ₂ Cl	J-29-48
N(n-Pr) ₂	J-29-43	4-嗎福啉基	J-29-45	CH ₂ Br	J-29-48
1-六氫吡啶基	J-29-43	CH ₃	J-29-46	CH ₂ I	J-29-48
1-四氫吡咯基	J-29-43	CH ₂ Cl	J-29-46	OH	J-29-48
4-嗎福啉基	J-29-43	CH ₂ Br	J-29-46	OMe	J-29-48
CH ₃	J-29-44	CH ₂ I	J-29-46	OEt	J-29-48
CH ₂ Cl	J-29-44	OH	J-29-46	OPr	J-29-48
CH ₂ Br	J-29-44	OMe	J-29-46	O-i-Pr	J-29-48
CH ₂ I	J-29-44	OEt	J-29-46	O-n-Bu	J-29-48
OH	J-29-44	OPr	J-29-46	O-t-Bu	J-29-48

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
NMe ₂	J-29-48	1-六氫吡啶基	J-29-50	CH ₃	J-29-53
NEt ₂	J-29-48	1-四氫吡咯基	J-29-50	CH ₂ Cl	J-29-53
N(n-Pr) ₂	J-29-48	4-嗎福啉基	J-29-50	CH ₂ Br	J-29-53
1-六氫吡啶基	J-29-48	CH ₃	J-29-51	CH ₂ I	J-29-53
1-四氫吡咯基	J-29-48	CH ₂ Cl	J-29-51	OH	J-29-53
4-嗎福啉基	J-29-48	CH ₂ Br	J-29-51	OMe	J-29-53
CH ₃	J-29-49	CH ₂ I	J-29-51	OEt	J-29-53
CH ₂ Cl	J-29-49	OH	J-29-51	OPr	J-29-53
CH ₂ Br	J-29-49	OMe	J-29-51	O-i-Pr	J-29-53
CH ₂ I	J-29-49	OEt	J-29-51	O-n-Bu	J-29-53
OH	J-29-49	OPr	J-29-51	O-t-Bu	J-29-53
OMe	J-29-49	O-i-Pr	J-29-51	NMe ₂	J-29-53
OEt	J-29-49	O-n-Bu	J-29-51	NEt ₂	J-29-53
OPr	J-29-49	O-t-Bu	J-29-51	N(n-Pr) ₂	J-29-53
O-i-Pr	J-29-49	NMe ₂	J-29-51	1-六氫吡啶基	J-29-53
O-n-Bu	J-29-49	NEt ₂	J-29-51	1-四氫吡咯基	J-29-53
O-t-Bu	J-29-49	N(n-Pr) ₂	J-29-51	4-嗎福啉基	J-29-53
NMe ₂	J-29-49	1-六氫吡啶基	J-29-51	CH ₃	J-29-54
NEt ₂	J-29-49	1-四氫吡咯基	J-29-51	CH ₂ Cl	J-29-54
N(n-Pr) ₂	J-29-49	4-嗎福啉基	J-29-51	CH ₂ Br	J-29-54
1-六氫吡啶基	J-29-49	CH ₃	J-29-52	CH ₂ I	J-29-54
1-四氫吡咯基	J-29-49	CH ₂ Cl	J-29-52	OH	J-29-54
4-嗎福啉基	J-29-49	CH ₂ Br	J-29-52	OMe	J-29-54
CH ₃	J-29-50	CH ₂ I	J-29-52	OEt	J-29-54
CH ₂ Cl	J-29-50	OH	J-29-52	OPr	J-29-54
CH ₂ Br	J-29-50	OMe	J-29-52	O-i-Pr	J-29-54
CH ₂ I	J-29-50	OEt	J-29-52	O-n-Bu	J-29-54
OH	J-29-50	OPr	J-29-52	O-t-Bu	J-29-54
OMe	J-29-50	O-i-Pr	J-29-52	NMe ₂	J-29-54
OEt	J-29-50	O-n-Bu	J-29-52	NEt ₂	J-29-54
OPr	J-29-50	O-t-Bu	J-29-52	N(n-Pr) ₂	J-29-54
O-i-Pr	J-29-50	NMe ₂	J-29-52	1-六氫吡啶基	J-29-54
O-n-Bu	J-29-50	NEt ₂	J-29-52	1-四氫吡咯基	J-29-54
O-t-Bu	J-29-50	N(n-Pr) ₂	J-29-52	4-嗎福啉基	J-29-54
NMe ₂	J-29-50	1-六氫吡啶基	J-29-52	CH ₃	J-29-55
NEt ₂	J-29-50	1-四氫吡咯基	J-29-52	CH ₂ Cl	J-29-55
N(n-Pr) ₂	J-29-50	4-嗎福啉基	J-29-52	CH ₂ Br	J-29-55

M	J ¹	M	J ¹	M	J ¹
CH ₂ I	J-29-55	O-i-Pr	J-29-56	N(n-Pr) ₂	J-29-57
OH	J-29-55	O-n-Bu	J-29-56	1-六氫吡啶基	J-29-57
OMe	J-29-55	O-t-Bu	J-29-56	1-四氫吡咯基	J-29-57
OEt	J-29-55	NMe ₂	J-29-56	4-嗎福啉基	J-29-57
OPr	J-29-55	NEt ₂	J-29-56	CH ₃	J-29-58
O-i-Pr	J-29-55	N(n-Pr) ₂	J-29-56	CH ₂ Cl	J-29-58
O-n-Bu	J-29-55	1-六氫吡啶基	J-29-56	CH ₂ Br	J-29-58
O-t-Bu	J-29-55	1-四氫吡咯基	J-29-56	CH ₂ I	J-29-58
NMe ₂	J-29-55	4-嗎福啉基	J-29-56	OH	J-29-58
NEt ₂	J-29-55	CH ₃	J-29-57	OMe	J-29-58
N(n-Pr) ₂	J-29-55	CH ₂ Cl	J-29-57	OEt	J-29-58
1-六氫吡啶基	J-29-55	CH ₂ Br	J-29-57	OPr	J-29-58
1-四氫吡咯基	J-29-55	CH ₂ I	J-29-57	O-i-Pr	J-29-58
4-嗎福啉基	J-29-55	OH	J-29-57	O-n-Bu	J-29-58
CH ₃	J-29-56	OMe	J-29-57	O-t-Bu	J-29-58
CH ₂ Cl	J-29-56	OEt	J-29-57	NMe ₂	J-29-58
CH ₂ Br	J-29-56	OPr	J-29-57	NEt ₂	J-29-58
CH ₂ I	J-29-56	O-i-Pr	J-29-57	N(n-Pr) ₂	J-29-58
OH	J-29-56	O-n-Bu	J-29-57	1-六氫吡啶基	J-29-58
OMe	J-29-56	O-t-Bu	J-29-57	1-四氫吡咯基	J-29-58
OEt	J-29-56	NMe ₂	J-29-57	4-嗎福啉基	J-29-58
OPr	J-29-56	NEt ₂	J-29-57		

上文表 8 係確認特定化合物，其包含選自 J-29-1 至 J-29-58 之 J 基團。因許多 J-29-1 至 J-29-58 包含一個對掌中心，故此等 J 基團係以特定對掌異構物組態圖解，其在一些情況中可提供關於式 1 化合物之最大殺真菌活性。熟諳此藝者立即明瞭關於所列示各化合物之對映體(意即相反對掌異構物)，且進一步明瞭對掌異構物可以純對掌異構物，或以富含一種對掌異構物之混合物，或以外消旋混合物存在。

配方/利用性

本發明之式 1 化合物係一般性地在組合物意即配方中作為殺真菌活性成份使用，伴隨著至少一種其他成份，選自

包括界面活性劑、固體稀釋劑及液體稀釋劑，其係充作載劑。配方或組合物成份係經選擇，以與活性成份之物理性質、施用模式及環境因素一致，該因素譬如土壤類型、水份及溫度。

- 5 可使用之配方包括液體與固體組合物兩者。液體組合物包括溶液(包括可乳化濃縮液)、懸浮液、乳化液(包括微乳化液及/或懸浮乳化液)等，其視情況可被稠化成凝膠。一般類型之水性液體組合物為可溶性濃縮液、懸浮濃縮液、膠囊懸浮液、濃縮乳化液、微乳化液及懸浮乳化液。一般
10 類型之非水性液體組合物為可乳化濃縮液、微可乳化濃縮液、可分散性濃縮液及油分散液。

- 15 一般類型之固體組合物為粉劑、粉末、顆粒、丸粒、丸劑、錠劑、片劑、經充填薄膜(包括種子塗層)等，其可為水可分散性("可潤濕")或水溶性。製自可形成薄膜溶液或可流動懸浮液之薄膜與塗層，係特別可用於種子處理。活性成份可經(微)包覆，且進一步製成懸浮液或固體配方；或者，活性成份之整個配方可被包覆(或"外塗覆")。包覆可控制或延遲活性成份之釋出。可乳化顆粒係結合可乳化濃縮液配方與乾燥粒狀配方兩者之優點。高濃度組合物係主
20 要作為中間物使用，以供進一步調配。

可噴霧配方典型上係於噴霧之前，在適當媒質中擴大。此種液體與固體配方係經調配，以容易地在噴霧媒質中稀釋，通常為水。噴霧體積可涵蓋每公頃從約一至數千升之範圍，但更典型上係在每公頃約十至數百升之範圍內。可

噴霧配方可為與水或另一種適當媒質混合之槽桶，藉由空中或地面施用，供葉部處理，或供施用至植物之生長中之媒質。液體與無水配方可在種植期間，直接計量至滴注灌溉系統中，或計量加入溝槽中。液體與固體配方可在種植之前施加至植物種子上，作為種子處理劑，以保護發育中之根部及其他地下植物部份及/或經過系統吸收至葉部。

配方典型上含有有效量之活性成份、稀釋劑及界面活性劑，在下文約略範圍內，其係加到至高100重量百分比。

	重量百分比		
	活性成份	稀釋劑	界面活性劑
水可分散性與水溶性顆粒、片劑及粉末	0.001-90	0-99.999	0-15
油分散液、懸浮液、乳化液、溶液(包括可乳化濃縮液)	1-50	40-99	0-50
粉劑	1-25	70-99	0-5
顆粒與丸粒	0.001-99	5-99.999	0-15
高濃度組合物	90-99	0-10	0-2

固體稀釋劑包括例如黏土，譬如膨土、蒙脫土、鎂鋁海泡石及高嶺土，石膏、纖維素、二氧化鈦、氧化鋅、澱粉、糊精、糖類(例如乳糖、蔗糖)、矽石、滑石、雲母、矽藻土、尿素、碳酸鈣、碳酸鈉與重碳酸鈉及硫酸鈉。典型固體稀釋劑係被描述於 Watkins 等人，殺昆蟲劑粉劑稀釋劑與載劑手冊，第2版，Dorland 書籍，Caldwell, New Jersey 中。

液體稀釋劑包括例如水、N,N-二甲基烷醯胺(例如 N,N-二甲基甲醯胺)、檸檬烯、二甲亞砷、N-烷基四氫吡咯酮類(例如 N-甲基四氫吡咯酮)、乙二醇、三乙二醇、丙二醇、二丙二醇、聚丙二醇、碳酸丙烯酯、碳酸丁烯酯、石蠟(例如白

色礦油、正石蠟、異構石蠟)、烷基苯、烷基萘、甘油、甘油三醋酸酯、花楸醇、三醋酸甘油酯、芳族烴類、去芳香化脂肪族化合物、烷基苯、烷基萘，酮類譬如環己酮、2-庚酮、異樹根皮酮及4-羥基-4-甲基-2-戊酮，醋酸酯類譬如醋酸異戊酯、醋酸己酯、醋酸庚酯、醋酸辛酯、醋酸壬酯、醋酸十三基酯及醋酸異呋萜酯，其他酯類譬如烷基化乳酸酯類、二鹽基性酯類及 γ -丁內酯，及醇類，其可為線性、分枝狀、飽和或不飽和，譬如甲醇、乙醇、正-丙醇、異丙醇、正-丁醇、異丁醇、正-己醇、2-乙基己醇、正-辛醇、癸醇、異癸基醇、異十八醇、鯨蠟醇、月桂基醇、十三醇、油醇、環己醇、四氫呋喃甲醇、雙丙酮醇及苜醇。液體稀釋劑亦包括飽和與不飽和脂肪酸類(典型上為C6-C22)甘油酯類，譬如植物種子與果實油類(例如橄欖、蓖麻、亞麻子、芝麻、玉蜀黍(玉米)、花生、葵花、葡萄籽、紅花、棉籽、大豆、菜籽、椰子及棕櫚核之油類)、動物來源之脂肪類(例如牛脂、豬脂、豬油、魚肝油、魚油)及其混合物。液體稀釋劑亦包括烷基化脂肪酸類(例如甲基化、乙基化、丁基化)，其中脂肪酸類可藉由得自植物與動物來源之甘油酯類之水解作用獲得，且可藉蒸餾純化。典型液體稀釋劑係描述於 Marsden, 溶劑指引, 第2版, Interscience, New York, 1950 中。

本發明之固體與液體組合物經常包含一或多種界面活性劑。界面活性劑可被分類為非離子性、陰離子性或陽離子性。可用於本發明組合物之非離子性界面活性劑，包括但不限於：醇烷氧基化物，譬如以天然與合成醇類(其可為分

- 枝狀或線性)為基料，且製自該醇類與環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物之醇烷氧基化物；胺乙氧基化物、烷醇醯胺類及乙氧基化烷醇醯胺類；經烷氧基化之三酸甘油酯，譬如乙氧基化大豆、蓖麻及菜籽油類；烷基酚烷氧基化物，譬如辛基酚乙氧基化物、壬基酚乙氧基化物、二壬基酚乙氧基化物及十二基酚乙氧基化物(製自酚類與環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物)；嵌段聚合體，製自環氧乙烷或環氧丙烷，與逆嵌段聚合體，其中末端嵌段係製自環氧丙烷；乙氧基化脂肪酸類；乙氧基化脂肪酯類與油類；乙氧基化甲基酯類；乙氧基化三苯乙基基酚(包括製自環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物者)；脂肪酸酯類、甘油酯類、羊毛脂為基料之衍生物，聚乙氧基化酯類，譬如聚乙氧基化花楸聚糖脂肪酸酯類、聚乙氧基化花楸醇脂肪酸酯類及聚乙氧基化甘油脂肪酸酯類；其他花楸聚糖衍生物，譬如花楸聚糖酯類；聚合體界面活性劑，譬如無規則共聚物、嵌段共聚物、烷基PEG(聚乙二醇)樹脂、接枝或梳型聚合體及星形聚合物；聚乙二醇(peg)；聚乙二醇脂肪酸酯類；聚矽氧為基料之界面活性劑；及糖衍生物，譬如蔗糖酯類、烷基多糖及烷基多醣。
- 可使用之陰離子性界面活性劑包括但不限於：烷基芳基磺酸及其鹽；羧基化醇或烷基酚乙氧基化物；二苯基磺酸鹽衍生物；木質素與木質素衍生物，譬如木質磺酸鹽；順丁烯二酸或琥珀酸類或其酐類；烯烴磺酸鹽；磷酸酯類，譬如醇烷氧基化物之磷酸酯類、烷基酚烷氧基化物之磷酸

酯類及苯乙烯基酚乙氧基化物之磷酸酯類；蛋白質為基料之界面活性劑；肌胺酸衍生物；苯乙烯基酚醚硫酸鹽；油類與脂肪酸類之硫酸鹽與磺酸鹽；乙氧基化烷基酚類之硫酸鹽與磺酸鹽；醇類之硫酸鹽；乙氧基化醇類之硫酸鹽；

5 胺類與醯胺類之磺酸鹽，譬如N,N-烷基牛磺酸鹽；苯、異丙苯、甲苯、二甲苯及十二基與十三基苯類之磺酸鹽；縮合萘之磺酸鹽；萘與烷基萘之磺酸鹽；分餾石油之磺酸鹽；磺酸基醯胺丁酸鹽；以及磺酸基琥珀酸鹽及其衍生物，譬如二烷基磺酸基琥珀酸鹽。

10 可使用之陽離子性界面活性劑包括但不限於：醯胺類與乙氧基化醯胺類；胺類，譬如N-烷基丙烷二胺類、三丙三胺類及二丙四胺類，與乙氧基化胺類、乙氧基化二胺類及丙氧基化胺類(製自胺類與環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物)；胺鹽，譬如胺醋酸鹽與二胺鹽；四級銨鹽，

15 譬如四級鹽、乙氧基化四級鹽及雙四級鹽；及胺氧化物，譬如烷基二甲胺氧化物與雙-(2-羥乙基)-烷基胺氧化物。

亦可用於本發明組合物者為非離子性與陰離子性界面活性劑之混合物，或非離子性與陽離子性界面活性劑之混合物。非離子性、陰離子性及陽離子性界面活性劑及其建議

20 之用途，係揭示於多種已出版之參考資料中，包括 McCutcheon 氏乳化劑與清潔劑，美國與國際版年刊，由 McCutcheon 之部門出版，糖果製造商出版公司；Sisely 與 Wood, 表面活性劑百科全書，化學出版公司，New York, 1964；與 A. S. Davidson 與 B. Milwidsky, 合成清潔劑，第七版，John Wiley &

Sons, New York, 1987。

本發明之組合物亦可含有熟諳此藝者所已知之配方輔助劑與添加劑，作為配方助劑。此種配方輔助劑與添加劑可控制：加工處理期間之pH（緩衝劑）、發泡（消泡劑，譬如
5 聚有機矽氧烷（例如 Rhodorsil® 416））、活性成份之沉降（懸浮劑）、黏度（觸變增稠劑）、容器中微生物生長（抗微生物劑）、產物冷凍（防凍劑）、顏色（染料/顏料分散體（例如 Pro-Ized® 著色劑紅色））、洗除（薄膜形成劑或附著劑）、蒸發（蒸發阻滯劑）及其他配方特質。薄膜形成劑包括例如聚醋酸乙烯
10 酯、聚醋酸乙烯酯共聚物、聚乙烷基四氫吡咯酮-醋酸乙烯酯共聚物、聚乙烯醇、聚乙烯醇共聚物及蠟類。配方輔助劑與添加劑之實例包括列示於 McCutcheon 氏第2卷：功能性物質，國際與北美版年刊，由 McCutcheon 之部門出版，糖果製造商出版公司；及 PCT 公報 WO 03/024222 中者。

15 溶液，包括可乳化濃縮液，可藉由單純地將諸成份混合而製成。若意欲作為可乳化濃縮液使用之液體組合物之溶劑為水不可溶混，則典型上係在以水稀釋時添加乳化劑，以乳化含活性物之溶劑。具有粒子直徑至高2,000微米之活性成份漿液，可使用介質磨機被濕磨，以獲得具有平均直
20 徑低於3微米之粒子。含水漿液可被製成最後完成之懸浮濃縮液（參閱，例如 U.S. 3,060,084），或藉由噴霧乾燥進一步處理，以形成水可分散性顆粒。乾燥配方通常需要乾磨過程，其會產生平均粒子直徑在2至10微米之範圍內。粉劑與粉末可藉由摻合且經常研磨而製成，如在擊鎚磨機或流體能磨

機中。顆粒與丸粒可經由將活性物質噴霧在預形成之粒狀載體上，或藉由黏聚技術製成。參閱 Browning, "黏聚", 化學工程, 1967 年 12 月 4 日, 第 147-48 頁, Perry 氏化學工程師手冊, 第 4 版, McGraw-Hill, New York, 1963, 第 8-57 頁及其下文, 與 WO91/13546。丸粒可按 U.S. 4,172,714 中所述製成。水可分散性與水溶性顆粒可按 U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 及 DE 3,246,493 中所陳述而製成。片劑可按 U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 及 U.S. 5,208,030 中所陳述而製成。薄膜可按 GB 2,095,558 與 U.S. 3,299,566 中所陳述而製成。

關於配方技藝之進一步資訊, 可參閱 T. S. Woods, "配方設計師之工具箱-供現代農業用之產物形式" 在除害劑化學與生物科技中, 食品環境挑戰, T. Brooks 與 T. R. Roberts 編著, 第 9 屆國際除害劑化學會議會刊, 皇家化學學會, Cambridge, 1999, 第 120-133 頁。亦參閱 U.S. 3,235,361, 第 6 欄第 16 行至第 7 欄第 19 行及實例 10-41; U.S. 3,309,192, 第 5 欄第 43 行至第 7 欄第 62 行及實例 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 及 169-182; U.S. 2,891,855, 第 3 欄第 66 行至第 5 欄第 17 行及實例 1-4; Klingman, 作為一項科學之雜草防治, John Wiley & Sons 公司, New York, 1961, 第 81-96 頁; Hance 等人, 雜草防治手冊, 第 8 版, Blackwell 科學刊物, Oxford, 989; 及調配技術上之發展, PJB 刊物, Richmond, UK, 2000。

於下述實例中, 所有百分比均為重量比, 且所有配方係以習用方式製備。化合物編號係指在索引表 A 中之化合物。

實例 A

高濃度濃縮物

化合物 1	98.5%
矽石充氣膠體	0.5%
合成非晶質微細矽石	1.0%.

實例 B

可潤濕粉末

化合物 2	65.0%
十二基酚聚乙二醇醚	2.0%
木質素磺酸鈉	4.0%
矽鋁酸鈉	6.0%
蒙脫土(經煨燒)	23.0%.

5

實例 C

顆粒

化合物 16	10.0%
鎂鋁海泡石顆粒(低揮發物， 0.71/0.30 毫米； U.S.S. 編號 25-50 篩網)	90.0%

實例 D

含水懸浮液

化合物 37	25.0%
水合鎂鋁海泡石	3.0%
粗製木質素磺酸鈣	10.0%
磷酸二氫鈉	0.5%
水	61.5%.

10

實例 E

壓出之丸粒

化合物 107	25.0%
無水硫酸鈉	10.0%
粗製木質素磺酸鈣	5.0%
烷基萘磺酸鈉	1.0%
鈣/鎂膨土	59.0%

實例 F

微乳化液

化合物 44	1.0%
三醋酸甘油酯	30.0%
C ₈ -C ₁₀ 烷基多糖	30.0%
單油酸甘油酯	19.0%
水	20.0%

實例 G

可乳化濃縮液

化合物 1	10.0%
C ₈ -C ₁₀ 脂肪酸甲酯	70.0%
聚氧化乙烯花楸醇六油酸酯	20.0%

本發明之式 1 化合物可作為植物疾病控制劑使用。因此，本發明進一步包括一種控制因真菌植物病原所造成植物疾病之方法，其包括對欲被保護之植物或其部份或對欲被保護之植物種子施用有效量之本發明化合物或含有該化合物之殺真菌組合物。本發明之化合物及/或組合物係提供因寬廣範圍之真菌植物病原所造成疾病之控制，該病原係在擔子菌綱、子囊菌綱、卵菌綱及半知菌綱種類中。其係有效

控制寬廣範圍之植物疾病，特別是裝飾、草地、蔬菜、田野、穀類及果實作物之葉病原。此等病原包括：卵菌綱，包括疫霉屬疾病，譬如致病疫霉、大雄疫霉、寄生疫霉、樟疫霉及辣椒疫霉，腐霉屬疾病，譬如瓜果腐霉，及在霜霉科中之疾病，譬如葡萄生單軸霉、霜霉屬(包括輻裂霜霉與寄生霜霉)、假霜霉屬(包括古巴假霜霉)及萵苣盤梗霉；子囊菌綱，包括鏈格孢屬疾病，譬如茄鏈格孢與蕓苔鏈格孢，球座菌屬疾病，譬如葡萄球座菌，黑星菌屬疾病，譬如蘋果黑星菌，殼針孢屬疾病，譬如穎枯殼針孢與小麥殼針孢，麥類白粉病疾病，譬如白粉菌屬(包括禾白粉菌與蓼白粉菌)、葡萄鉤絲殼、蒼耳單絲殼與白叉絲單囊殼、卷毛狀假小尾孢屬，葡萄孢屬疾病，譬如灰葡萄孢、果生鏈核盤菌，核盤菌疾病，譬如核盤菌、灰 *Magnaporthe*、葡萄生擬莖點霉，長蠕孢屬疾病，譬如堰麥草長蠕孢、圓核腔菌，葡萄藤黑腐病，譬如小叢殼屬或刺盤孢屬(譬如禾生刺盤孢與正圓刺盤孢)及禾頂囊殼；擔子菌綱，包括銹疾病，因以下所造成，柄銹菌屬(譬如隱匿柄銹菌、條形柄銹菌、大麥柄銹菌、禾柄銹菌及落花生柄銹菌)、咖啡駝孢銹菌與豆薯層銹菌；其他病原，包括絲核菌屬(譬如立枯絲核菌)；鐮孢菌屬疾病，譬如粉紅鐮孢、禾本科鐮孢及尖鐮孢；大麗花輪枝孢；齊整小核菌；黑麥喙孢；球座尾孢、落花生尾孢及恭菜生尾孢；及密切關於此等病原之其他種屬與物種。除了其殺真菌活性以外，組合物或組合亦具有活性以抵抗細菌，譬如解澱粉歐文氏菌、野油菜黃單胞菌、丁香

假單胞菌及其他相關物種。值得注意的是，提供控制因子囊菌綱與卵菌綱種類所造成之疾病。特別值得注意的是，提供控制因卵菌綱種類所造成之疾病。

植物疾病控制通常係藉由施用有效量之本發明化合物達成，無論是感染前或感染後，對欲被保護之植物部份，譬如根、莖、葉、果實、種子、塊莖或球莖，或對其中欲被保護之植物正在生長中之介質(土壤或砂)。化合物亦可被施加至種子，以保護種子，及正從該種子發育之籽苗。化合物亦可經過灌溉水施加，以處理植物。

此等化合物之施用率可被許多環境因素所影響，且應依實際使用條件決定。當在低於約1克/公頃至約5,000克/公頃活性成份之比率下處理時，葉部通常可被保護。當種子係在每千克種子約0.1至約10克之比率下處理時，種子與籽苗通常可被保護。

本發明化合物亦可與一或多種其他殺昆蟲劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、殺細菌劑、殺蟎劑、生長調節劑、化學消毒劑、半化學品、拒斥劑、吸引劑、信息素、進食刺激劑或其他生物活性化合物混合，以形成多成份除害劑，獲得又更寬廣範圍之農業保護。本發明化合物可與其一起調配之此種農業保護劑之實例係為：殺昆蟲劑，譬如阿巴美克叮(abamectin)、阿西菲特(acephate)、阿西塔米得(acetamiprid)、醯胺弗美特(amidoflumet)(S-1955)、阿威美克叮(avermectin)、印苦棟子素、阿吡磷(azinphos)-甲基、雙吩斯林(bifenthrin)、雙吩那札特(bifenazate)、布普洛菲井(buprofezin)、卡巴呋喃

(carbofuran)、卡他普(cartap)、氯苯甲醯亞胺唑(chlorantraniliprole)
 (DPX-E2Y45)、氯芬那吡(chlorfenapyr)、氯氟阿如隆
 (chlorfluazuron)、氯皮利福斯(chlorpyrifos)、氯皮利福斯
 (chlorpyrifos)-甲基、色吩諾再得(chromafenozide)、氯噻尼定
 5 (clothianidin)、西弗美托吩(cyflumetofen)、西弗斯林(cyfluthrin)、
 β -西弗斯林(cyfluthrin)、西鹵斯林(cyhalothrin)、 λ -西鹵斯林
 (lambda-cyhalothrin)、西伯美斯林(cypermethrin)、西洛馬井
 (cyromazine)、 δ -美斯林(deltamethrin)、二吩速隆(diafenthion)、
 二吡農(diazinon)、狄氏劑、二氟苯如隆(diflubenzuron)、二美
 10 弗斯林(dimefluthrin)、樂果(dimethoate)、地諾提呋喃(dinotefuran)、
 迪歐吩蘭(diofenolan)、衣馬美克汀(emamectin)、恩多沙吩
 (endosulfan)、衣斯吩戊酸鹽(esfenvalerate)、乙西普羅利
 (ethiprole)、非諾硫卡巴(fenothiocarb)、非氧卡巴(fenoxycarb)、
 吩洛帕斯林(fenpropathrin)、吩戊酸鹽(fenvalerate)、菲洛尼爾
 15 (fipronil)、弗隆尼卡迷(flonicamid)、氟苯二醯胺(flubendiamide)、
 弗西斯林鹽(flucythrinate)、 τ -弗發林鹽(fluvalinate)、弗吩臬林
 (flufenerim)(UR-50701)、氟吩諾速隆(flufenoxuron)、發諾磷
 (fonophos)、鹵吩諾再得(halofenozide)、六氟慕隆(hexaflumuron)、
 海甲壬(hydramethylnon)、咪達可若利得(imidacloprid)、因噪沙
 20 卡巴(indoxacarb)、異吩磷(isofenphos)、路吩努隆(lufenuron)、馬
 拉硫磷(malathion)、美塔弗米宗(metaflumizone)、聚乙醛
 (metaldehyde)、甲胺磷(methamidophos)、美西達硫磷(methidathion)
 、美索米(methomyl)、美索普蘭(methoprene)、甲氧氯、美托弗
 斯林(metofluthrin)、久效磷(monocrotophos)、甲氧吩諾再得

(methoxyfenozide)、尼天比蘭(nitenpyram)、尼噁吡(nithiazine)、諾瓦路隆(novaluron)、諾維弗目隆(noviflumuron)(XDE-007)、草醯胺醯(oxamyl)、巴拉松、巴拉松-甲基、伯美斯林(permethrin)、甲拌磷(phorate)、伏殺磷(phosalone)、弗斯美特(phosmet)、磷胺(phosphamidon)、皮利米卡巴(pirimicarb)、普洛吩諾磷(profenofos)、普弗斯林(profluthrin)、皮美洛吡(pymetrozine)、吡拉弗普洛(pyrafluprole)、除蟲菊酯、吡利達里(pyridalyl)、吡弗昆那宗(pyrifluquinazon)、吡利普洛(pyriprole)、吡丙吩(pyriproxyfen)、苦楝藤酮、雷諾汀(ryanodine)、史賓托蘭(spinetoram)、旋諾賽得(spinosad)、螺二氯吩(spirodiclofen)、螺美西吩(spiromesifen)(BSN 2060)、螺四美特(spirotetramat)、硫普洛弗斯(sulprofos)、提布吩諾再得(tebufenozide)、提氟苯如隆(teflubenzuron)、提弗斯林(tefluthrin)、特布弗斯(terbufos)、殺蟲畏(tetrachlorvinphos)、噁可洛利得(thiacloprid)、噁美梭散(thiamethoxam)、硫二卡巴(thiodicarb)、硫蘇塔普(thiosultap)-鈉、拉多美斯林(tralomethrin)、三氮美特(triazamate)、敵百蟲(trichlorfon)及三氟慕隆(triflumuron)；殺真菌劑，譬如阿西苯唑拉(acibenzolar)、阿地莫夫(aldimorph)、安蘇溴(amisulbrom)、敵菌靈(anilazine)、氮康唑(azaconazole)、氧偶氮史托賓(azoxystrobin)、本那拉西(benalaxyl)、麥銹靈(benodanil)、苯菌靈(benomyl)、苯噁伐卡巴(benthiavalicarb)、苯噁伐卡巴(benthiavalicarb)-異丙基、樂殺蟎(binapacryl)、聯苯基、比特坦醇(bitertanol)、比沙吩(bixafen)、殺稻瘟菌素-S、波爾多混合物(三鹽基性硫酸銅)、玻斯卡利得(boscalid)/尼可必吩

(nicobifen)、溴母康唑(bromuconazole)、布吡美特(bupirimate)、
 布硫貝特(buthiobate)、萎銹靈(carboxin)、卡丙醯胺(carpropamid)、
 卡普塔弗(captafol)、克菌丹(captan)、多菌靈(carbendazim)、地
 茂散(chloroneb)、百菌清(chlorothalonil)、5-氯基-6-(2,4,6-三氟苯
 5 基)-7-(4-甲基六氫吡啶-1-基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶、氯索林
 鹽(chlozolate)、克羅三馬唑(clotrimazole)、氧氯化銅，銅鹽，
 譬如硫酸銅與氫氧化銅，西偶氮發醯胺(cyazofamid)、西弗吩
 醯胺(cyflufenamid)、西莫山尼(cymoxanil)、西普洛康唑
 (cyproconazole)、賽普洛的尼(cyprodinil)、二氯弗尼得
 10 (dichlofluanid)、二氯西美特(diclocymet)、二氯美井(diclomezin)、
 氯硝胺(dicloran)、二乙吩卡巴(diethofencarb)、二吩康唑
 (difenoconazole)、二氟美托林(diflumetorim)、二甲利莫
 (dimethirimol)、N-[2-(1,3-二甲基丁基)苯基]-5-氟基-1,3-二甲基
 -1H-吡唑-4-羧醯胺、二甲嗎福(dimethomorph)、二氧史托賓
 15 (dimoxystrobin)、二尼康唑(diniconazole)、二尼康唑
 (diniconazole)-M、敵蟎普(dinocap)、二可史托賓(discostrobin)、
 二噻農(dithianon)、多地嗎福(dodemorph)、多果定(dodine)、約
 康唑(econazole)、克瘟散(edifenphos)、恩史托布林(enestroburin)、
 環氧康唑(epoxiconazole)、衣他康唑(etaconazole)、乙沙巴克薩
 20 (ethaboxam)、乙菌定(ethirimol)、乙利二唑(ethridiazole)、發姆氧
 酮(famoxadone)、吩醯胺酮(fenamidone)、吩阿利莫(fenarimol)、
 吩布康唑(fenbuconazole)、吩卡醯胺(fencaramid)、吩夫蘭
 (fenfuram)、吩己醯胺(fenhexamid)、芬氧尼耳(fenoxanil)、吩吡
 若尼(fenpiclonil)、吩丙啉(fenpropidin)、吩丙嗎福(fenpropimorph)、

薯瘟錫醋酸鹽 (fentin acetate)、薯瘟錫 (fentin) 氯化物、毒菌錫
 (fentin hydroxide)、福美鐵 (ferbam)、弗呔拉坐 (ferfurazoate)、福
 林宗 (ferimzone)、氟阿吉南 (fluazinam)、氟二氧尼 (fludioxonil)、
 5 氟甲托勃 (flumetover)、弗嗎福 (flumorph)、氟皮可得 (fluopicolide)、
 氟吡喃 (fluopyram)、氟氧史托賓 (fluoxastrobin)、氟昆康唑
 (fluquinconazole)、氟昆康唑 (fluquinconazole)、氟矽氮唑
 (flusilazole)、氟胺基磺酸 (flusulfamide)、氟托拉尼 (flutolanil)、氟
 三阿弗 (flutriafol)、滅菌丹 (folpet)、弗謝替 (fosetyl)-鋁、福伯利
 答唑 (fuberidazole)、福瑞拉西 (furalaxyl)、弗拉塔吡 (furametapyr)、
 10 六康唑 (hexaconazole)、海美沙唑 (hymexazol)、雙胍鹽
 (guazatine)、衣馬雜利 (imazalil)、衣米苯康唑 (imibenconazole)、
 亞胺辛叮 (iminoctadine)、愛地卡巴 (iodicarb)、愛普康唑
 (ipconazole)、衣普洛苯弗斯 (iprobenfos)、衣普洛二酮 (iprodione)、
 依普洛維利卡巴 (iprovalicarb)、異康唑 (isoconazole)、富士一號
 15 (isoprothiolane)、異提安尼 (isotianil)、春日黴素、可列索克辛
 (kresoxim)- 甲基、代森錳鋅 (mancozeb)、門二丙醯胺
 (mandipropamid)、代森錳 (maneb)、馬巴尼比 (mapanipyrin)、美吩
 諾克山 (mefenoxam)、美若尼 (mepronil)、甲替敵蟎普
 (meptyldinocap)、美塔拉西 (metalaxyl)、美特康唑 (metconazole)、
 20 甲硫弗卡巴 (methasulfocarb)、代森聯 (metiram)、美托明史托賓
 (metominostrobin)、美帕尼吡林 (mepanipyrin)、代森聯 (metiram)、
 美托吩酮 (metrafenone)、米康唑 (miconazole)、麥可洛丁尼
 (myclobutanil)、那弗提芳 (naftifine)、新阿索辛 (neo-asozin)(甲烷
 脾酸鐵)、努阿利莫 (nuarimol)、奧西林酮 (octhilinone)、歐福瑞

斯(ofurace)、歐瑞沙史托賓(orysastrobin)、氧二西(oxadixyl)、噁
 啉酸、歐克波康唑(oxpoconazole)、氧化萎銹靈(oxycarboxin)、
 羥四環素、巴洛丁唑(paclobutrazol)、平康唑(penconazole)、平
 西古隆(pencycuron)、片硫吡得(penthiopyrad)、伯弗拉坐
 5 (perfurazoate)、磷酸、鄰苯二甲內酯、皮可苯醯胺
 (picobenzamid)、皮可氧史托賓(picoxystrobin)、粉病靈(piperalin)、
 多氧菌素(polyoxin)、噻菌靈(probenazole)、普洛氯來滋
 (prochloraz)、普洛西米酮(procymidone)、普洛帕莫卡巴
 (propamocarb)、普洛帕莫卡巴(propamocarb)-鹽酸鹽、普洛皮康
 10 唑(propiconazole)、甲基代森鋅(propineb)、普洛喹那得
 (proquinazid)、普洛硫卡巴(prothiocarb)、丙硫康唑
 (prothioconazole)、皮拉可洛史托賓(pyraclostrobin)、皮利氮磷
 (pyrazophos)、吡利苯卡巴(pyribencarb)、吡啉吩諾斯(pyrifenox)、
 吡啉美沙尼(pyrimethanil)、吡啉吩諾斯(pyrifenox)、吡洛尼林
 15 (pyrolnitrine)、吡咯昆隆(pyroquilon)、奎康唑(quinconazole)、奎
 氧吩(quinoxifen)、五氯硝基苯(quintozene)、矽硫法姆(silthiofam)、
 西美康唑(simeconazole)、螺氧胺(spiroxamine)、鏈黴素、硫磺、
 提布康唑(tebuconazole)、提可拉吡(tchrazene)、提可若弗塔蘭
 (tecloftalam)、提可那井(tecnazene)、特賓那芳(terbinafine)、四康
 20 唑(tetraconazole)、噻苯咪唑(thiabendazole)、噻氟醯胺
 (thifluzamide)、托布津(thiophanate)、甲基托布津(thiophanate-methyl)、
 福美雙(thiram)、提阿地尼(tiadinil)、托可洛弗斯(tolclofos)-甲
 基、托利弗尼(tolyfluanid)、三阿地美風(triadimefon)、三阿地
 孟醇(triadimenol)、三阿利莫(triarimol)、三唑氧(triazoxide)、三

環唑 (tricyclazole)、克啉菌 (tridemorph)、三氟米唑 (triflumizole)、三莫醯胺三環唑 (trimoprhamide tricyclazole)、三氟氧史托賓 (trifloxystrobin)、吡啶靈 (triforine)、三替康唑 (triticonazole)、單康唑 (uniconazole)、有效黴素、賓可若左林 (vinclozolin)、代森鋅 (zineb)、福美鋅 (ziram) 及坐克沙醯胺 (zoxamide)；殺線蟲劑，譬如涕滅威 (aldicarb)、醛卡巴 (aldoxycarb)、菲那米磷 (fenamiphos)、衣米西磷 (imicyafos) 及草醯胺醯 (oxamyl)；殺細菌劑，譬如鏈黴素；殺蟎劑，譬如阿米蔡司 (amitraz)、奇諾甲內特 (chinomethionat)、氯苯吉雷特 (chlorobenzilate)、西恩吡拉吩 (cyenopyrafen)、西六叮 (cyhexatin)、迪可弗 (dicofol)、迪恩氯 (dienochlor)、衣托嗎唑 (etoxazole)、吩那雜昆 (fenazaquin)、氧化吩布達叮 (fenbutatin oxide)、吩洛帕斯林 (fenpropathrin)、吩皮若西美特 (fenpyroximate)、己噁坐克斯 (hexythiazox)、丙炔蓋特 (propargite)、吡達苯 (pyridaben) 及提布吩皮拉得 (tebufenpyrad)；及生物劑，譬如蘇雲金芽孢桿菌、蘇雲金芽孢桿菌 δ 內毒素、桿狀病毒及昆蟲病原細菌、病毒及真菌。上文所列示各種市購可得化合物之描述可參閱除害劑手冊，第十三版，C.D.S. Thomlin 編著，英國農作物保護會議，2003。關於其中使用一或多種此等不同混合配對物之具體實施例，此等不同混合配對物 (總計) 對式 1 化合物之重量比，典型上係在約 1:100 與約 3000:1 之間。值得注意的是，在約 1:30 與約 300:1 間之重量比 (例如在約 1:1 與約 30:1 間之比例)。得以顯見的是，包含此等其他成份可擴大經控制之疾病範圍，超過單獨被式 1 化合物所控制之範圍。

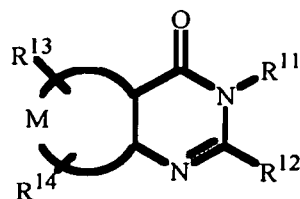
在一項混合物具體實施例中，包含式1化合物之固體組合物之顆粒係與包含另一種農業保護劑之固體組合物之顆粒混合。此等顆粒混合物可為根據PCT專利公報WO 94/24861之一般顆粒混合物揭示內容，或更佳為美國專利6,022,552之均質顆粒混合物陳述內容。

值得注意的是，式1化合物與至少一種其他殺真菌劑之組合(例如呈組合物形式)。特別值得注意的是，此種組合，其中另一種殺真菌劑具有與式1化合物不同之作用位置。在某些情況中，與具有類似控制範圍但不同作用位置之其他殺真菌劑之組合，對抗藥性處理係特別有利。特別值得注意的是，除了式1化合物以外，包含至少一種以下化合物之組合物，選自包括(1)次烷基雙(二硫代胺基甲酸酯)殺真菌劑；(2)西莫山尼(cymoxanil)；(3)苯基醯胺殺真菌劑；(4)嘧啶酮殺真菌劑；(5)百菌清(chlorothalonil)；(6)羧醯胺類，作用在真菌粒線體呼吸道電子轉移位置之複合物II下；(7)奎氧吩(quinoxyfen)；(8)美托吩酮(metrafenone)；(9)西弗吩醯胺(cyflufenamid)；(10)賽普洛的尼(cyprodinil)；(11)銅化合物；(12)鄰苯二甲醯亞胺殺真菌劑；(13)弗謝替(fosetyl)-鋁；(14)苯并咪唑殺真菌劑；(15)西偶氮發醯胺(cyazofamid)；(16)氟阿吉南(fluazinam)；(17)依普洛維利卡巴(iprovalicarb)；(18)普洛帕莫卡巴(propamocarb)；(19)維利黴素(validomycin)；(20)二氯苯基二羧醯亞胺殺真菌劑；(21)坐克沙醯胺(zoxamide)；(22)氟皮可得(fluopicolide)；(23)門二丙醯胺(mandipropamid)；(24)羧酸醯胺類，作用在磷脂生物合成與細胞壁沉積上；(25)二甲嗎福

(dimethomorph)；(26) 非 DMI 固醇生物合成抑制劑；(27) 脫甲基酶在固醇生物合成上之抑制劑；(28) bc_1 複合物殺真菌劑；及(1)至(28)化合物之鹽。

殺真菌化合物種類之進一步描述係提供於下文。

5 嘧啶酮殺真菌劑(組群(4))包含式 A1 化合物



A1

其中 M 係形成稠合苯基、噻吩或哌啶環； R^{11} 為 C_1 - C_6 烷基； R^{12} 為 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 烷氧基； R^{13} 為鹵素；且 R^{14} 為氫或鹵素。

10 嘧啶酮殺真菌劑係描述於 PCT 專利申請案公報 WO 94/26722 及美國專利 6,066,638, 6,245,770, 6,262,058 及 6,277,858 中。

值得注意的是，嘧啶酮殺真菌劑，選自以下組群：6-溴基-3-丙基-2-丙氧基-4(3H)-喹唑啉酮，6,8-二碘基-3-丙基-2-丙氧基-4(3H)-喹唑啉酮，6-碘基-3-丙基-2-丙氧基-4(3H)-喹唑啉酮(普洛喹那得(proquinazid))，6-氯基-2-丙氧基-3-丙基-噻吩并[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮，6-溴基-2-丙氧基-3-丙基噻吩并[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮，7-溴基-2-丙氧基-3-丙基噻吩并[3,2-d]嘧啶-4(3H)-酮，6-溴基-2-丙氧基-3-丙基哌啶并[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮，6,7-二溴基-2-丙氧基-3-丙基-噻吩并[3,2-d]嘧啶-4(3H)-酮，及3-(環丙基甲基)-6-碘基-2-(丙基硫基)哌啶并-[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮。

固醇生物合成抑制劑(組群(27))係在固醇生物合成途徑

中藉由抑制酵素而控制真菌。脫甲基酶抑制性殺真菌劑在真菌固醇生物合成途徑內具有共同作用位置，涉及抑制脫甲基作用，在羊毛硬脂醇或24-亞甲基二氫羊毛硬脂醇之位置14上，其係為真菌中對固醇之先質。作用在此位置之化合物係經常被稱為脫甲基酶抑制劑、DMI殺真菌劑或DMI。

5 脫甲基酶酵素有時係藉由生物化學文獻上之其他名稱指稱，包括細胞色素P-450 (14DM)。脫甲基酶酵素係被描述於例如J. Biol. Chem. 1992, 267, 13175-79及其中引述之參考資料中。DMI殺真菌劑係被區分在數種化學種類之間：氮唑類

10 (包括三唑類與咪唑類)、嘧啶類、六氫吡嘧啶類及嘧啶類。三唑類包括氮康唑(azaconazole)、溴母康唑(bromuconazole)、西普洛康唑(cyproconazole)、二吩康唑(difenoconazole)、二尼康唑(diniconazole)(包括二尼康唑(diniconazole)-M)、環氧康唑(epoxiconazole)、衣他康唑(etaconazole)、吩布康唑(fenbuconazole)、

15 氟昆康唑(fluquinconazole)、氟矽氮唑(flusilazole)、氟三阿弗(flutriafol)、六康唑(hexaconazole)、衣米苯康唑(imibenconazole)、愛普康唑(ipconazole)、美特康唑(metconazole)、麥可洛丁尼(myclobutanil)、平康唑(penconazole)、普洛皮康唑(propiconazole)、丙硫康唑(prothioconazole)、奎康唑(quinconazole)、西美康唑(simeconazole)、提布康唑(tebuconazole)、四康唑(tetraconazole)、

20 三阿地美風(triadimefon)、三阿地孟醇(triadimenol)、三替康唑(triticonazole)及單康唑(uniconazole)。咪唑類包括克羅三馬唑(clotrimazole)、約康唑(econazole)、衣馬雜利(imazalil)、異康唑(isoconazole)、米康唑(miconazole)、歐克波康唑(oxpoconazole)、

普洛氯來滋 (prochloraz) 及三氟米唑 (triflumizole) 。嘧啶類包括
吩阿利莫 (fenarimol) 、努阿利莫 (nuarimol) 及三阿利莫
(triarimol) 。六氫吡啶類包括吡啶胺 (triforine) 。嘧啶類包括布
硫貝特 (buthiobate) 與嘧啶吩諾斯 (pyrifenoxy) 。生物化學研究已
顯示所有上文所指出之殺真菌劑係為 DMI 殺真菌劑，如由
K. H. Kuck 等人在現代選擇性殺真菌劑 - 性質，應用及作用
機制, H. Lyr (編著), Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 205-258
中所述者。

bc₁ 複合物殺真菌劑 (組群 28) 具有殺真菌作用模式，其會
抑制粒線體呼吸鏈中之 bc₁ 複合物。bc₁ 複合物有時係藉由生
物化學文獻中之其他名稱指稱，包括電子轉移鏈之複合物
III 與泛醌：細胞色素 c 氧化還原酶。此複合物係獨特地被
確認為酵素委員會編號 EC1.10.2.2。bc₁ 複合物係被描述於例
如 J. Biol. Chem. 1989, 264, 14543-48; Methods Enzymol. 1986, 126,
253-71; 及其中引述之參考資料中。鏈體素殺真菌劑，譬如
氧偶氮史托賓 (azoxystrobin)、二氧史托賓 (dimoxystrobin)、恩史
托布林 (enestroburin)(SYP-Z071)、氟氧史托賓 (fluoxastrobin)、可
列索克辛 (kresoxim)-甲基、美托明史托賓 (metominostrobin)、歐
瑞沙史托賓 (orysastrobin)、皮可氧史托賓 (picoxystrobin)、皮拉
可洛史托賓 (pyraclostrobin) 及三氟氧史托賓 (trifloxystrobin) 係已
知具有此作用模式 (H. Sauter 等人, Angew. Chem. Int. Ed. 1999, 38,
1328-1349)。在粒線體呼吸鏈中會抑制 bc₁ 複合物之其他殺真
菌化合物，包括發姆氧酮 (famoxadone) 與吩醯胺酮 (fenamidone)。

次烷基雙(二硫代胺基甲酸酯)殺真菌劑 (組群 (1)) 包括一

些化合物，譬如代森錳鋅 (mancozeb)、代森錳 (maneb)、甲基代森鋅 (propineb) 及代森鋅 (zineb)。苯基醯胺殺真菌劑 (組群 (3)) 包括一些化合物，譬如美塔拉西 (metalaxyl)、本那拉西 (benalaxyl)、福瑞拉西 (furalaxyl) 及氧二西 (oxadixyl)。羧醯胺 (組群 (6)) 包括一些化合物，譬如玻斯卡利得 (boscalid)、萎銹靈 (carboxin)、吩夫蘭 (fenfuram)、氟托拉尼 (flutolanil)、弗拉美吡 (furametpyr)、美若尼 (mepronil)、氧化萎銹靈 (oxycarboxin)、噁氟醯胺 (thi fluzamide)、片硫吡得 (penthiopyrad) 及 N-[2-(1,3-二甲基丁基) 苯基]-5-氟基-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺 (PCT 專利公報 WO 2003/010149)，且已知係藉由在呼吸道電子輸送鏈中瓦解複合物 II (琥珀酸脫氫酶) 而抑制粒線體功能。銅化合物 (組群 (11)) 包括一些化合物，譬如氧氯化銅，硫酸銅，及氫氧化銅，包括一些組合物，譬如波爾多混合物 (三鹽基性硫酸銅)。鄰苯二甲醯亞胺殺真菌劑 (組群 (12)) 包括一些化合物，譬如滅菌丹 (folpet) 與克菌丹 (captan)。苯并咪唑殺真菌劑 (組群 (14)) 包括苯菌靈 (benomyl) 與多菌靈 (carbendazim)。二氯苯基二羧醯亞胺殺真菌劑 (組群 (20)) 包括氯索林鹽 (chlozolate)、二氯坐林 (dichlozoline)、衣普洛二酮 (iprodione)、異伐列二酮 (isovaledione)、麥可洛左林 (myclozolin)、普洛西米酮 (procymidone) 及賓可若左林 (vinclozolin)。

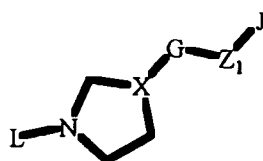
非 DMI 固醇生物合成抑制劑 (組群 (26)) 包括嗎福啉與六氫吡啶殺真菌劑。嗎福啉與六氫吡啶類為固醇生物合成抑制劑，其已被証實會抑制固醇生物合成途徑中之步驟，在比藉由 DMI 固醇生物合成所達成之抑制 ((組群 (27)) 稍後之點

下。嗎福啉類包括阿地莫夫 (aldimorph)、多地嗎福 (dodemorph)、吩丙嗎福 (fenpropimorph)、克啉菌 (tridemorph) 及三嗎福醯胺 (trimorphamide)。六氫吡啶類包括吩丙啉 (fenpropidin)。

值得注意的是，其中因卵菌綱真菌植物病原所造成之植物疾病係經控制之方法。

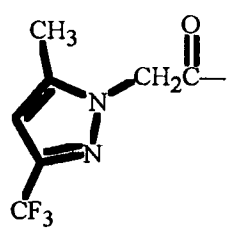
下述試驗係証實本發明化合物對特定病原之控制功效。但是，藉由化合物所提供之病原控制保護並不限於此等物種。參閱關於化合物描述之索引表 A。以 "R" (右旋) 與 "S" (左旋) 標識之立體中心係以如由化學文摘所使用之 Cahn-Ingold-Prelog 系統為基礎；立體中心標識接著為星號 "***"，係意謂立體化學描述係相對於其他立體中心，且該化合物為外消旋。縮寫 "Ex." 代表 "實例"，且係跟隨一個數目，表示化合物係在那一個實例中製成。索引表 A 係列出經由添加 H^+ (分子量為 1) 至分子所形成最高同位素豐度母離子 ($M+1$) 之分子量，藉由質量光譜法，使用大氣壓化學電離 (AP^+) 所發現。化合物 1 之對掌性分離成化合物 3 與 4 係使用預備之 CHIRALPAK® AD-RH 管柱 (對掌性技術公司，West Chester, PA, U.S.A.)，含有以溶膠澱粉-參 (3,5-二甲基苯基胺基甲酸酯) 塗覆之矽膠，並以水-甲醇梯度液溶離而達成。旋光率 ($[\alpha]_D$) 係在乙醇溶液中，於 25°C 下，使用 100-毫米路徑單元度量。

索引表 A

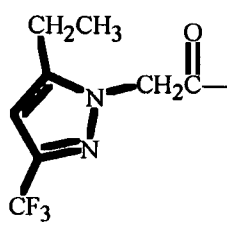


G 係如展示表 2 中之定義；在 G 中之 R^{3a} 為 H。L 基團係按

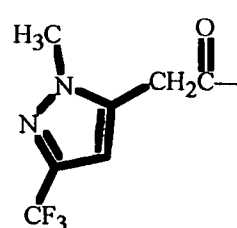
下文所示作定義。



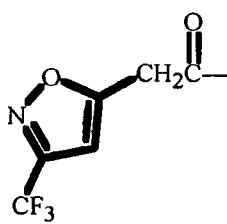
L-1



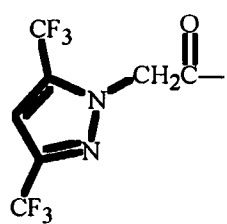
L-2



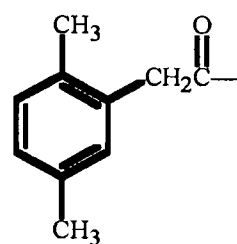
L-3



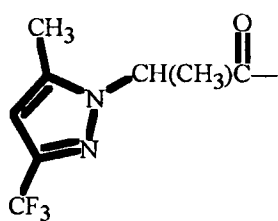
L-4



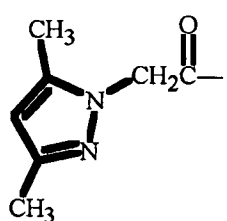
L-5



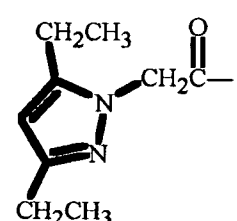
L-6



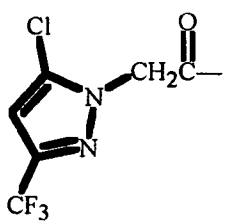
L-7



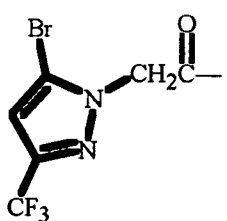
L-8



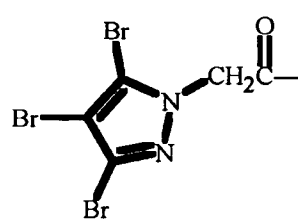
L-9



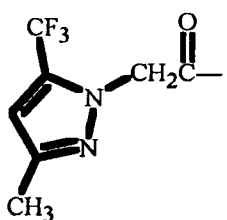
L-10



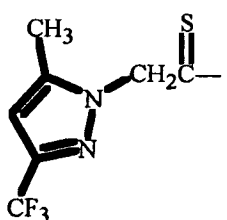
L-11



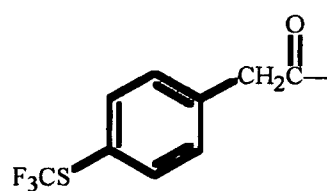
L-12



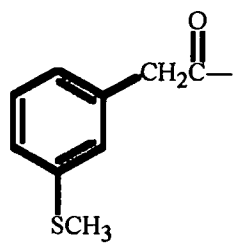
L-13



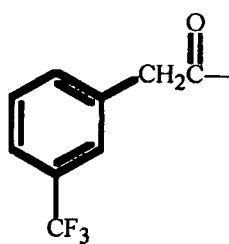
L-14



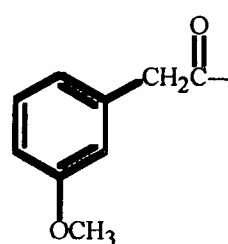
L-15



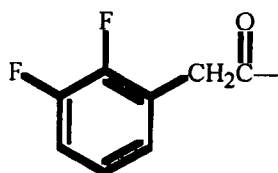
L-16



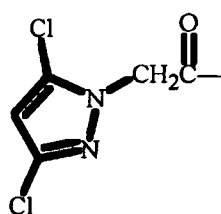
L-17



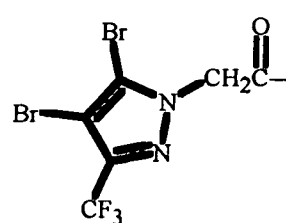
L-18



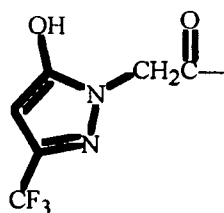
L-19



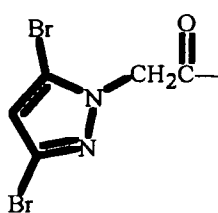
L-20



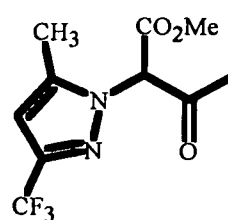
L-21



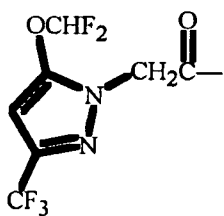
L-22



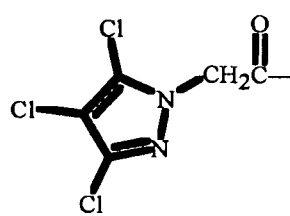
L-23



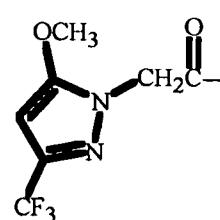
L-24



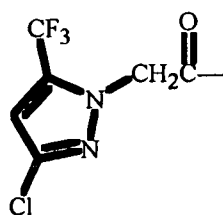
L-25



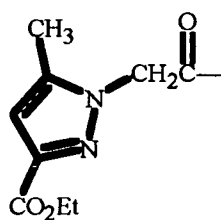
L-26



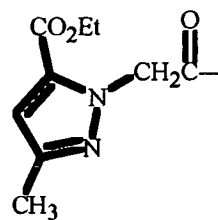
L-27



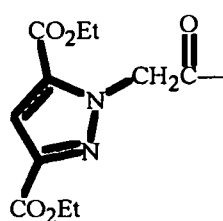
L-28



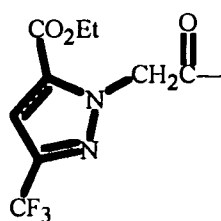
L-29



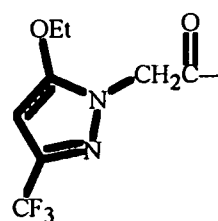
L-30



L-31

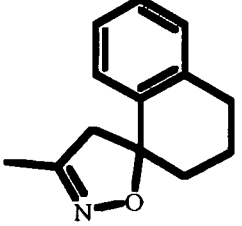
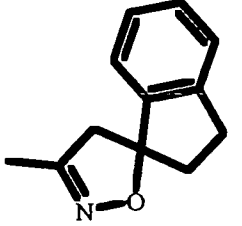
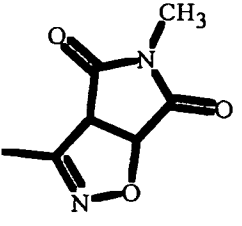


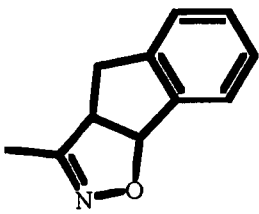
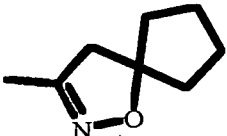
L-32



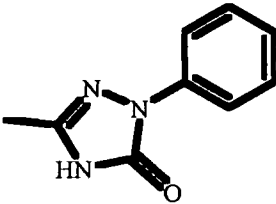
L-33

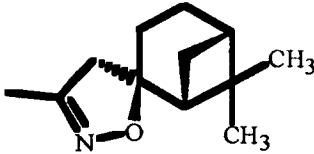
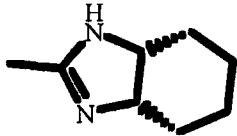
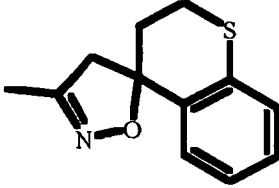
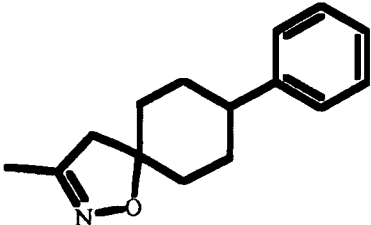
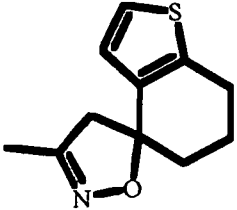
化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
1 (實例1)	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	504
2 (實例2)	L-1	X ¹	G-1	5-苯基-3-異噁唑基	502
3 (實例12)	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基[註1]	504
4	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基[註2]	504
5	L-1	X ¹	G-1	5,6-二氫-6-苯基-4H-1,2-噁吡-3-基	518
6 (實例4)	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-3-苯基-5-異噁唑基	504
7 (實例3)	L-1	X ¹	G-1	(5S)-4,5-二氫-1-甲基-5-苯基-1H- 咪唑-2-基	517
8 (實例5)	L-1	X ¹	G-1	5-(2-氯苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基	538
9	L-1	X ¹	G-1	5-(4-氯苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基	538
10	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(4-甲基苯基)-3-異噁唑基	518
11	L-1	X ¹	G-1	(4R**,5R**)-4,5-二氫-4-甲基-5-苯基-3- 異噁唑基	518
12	L-1	X ¹	G-27	3-苯基-1H-吡唑-1-基	483
13	L-1	X ¹	G-1	4-苯基-2-四氫噁唑基	506
14	L-1	X ¹	G-1	3-乙醯基-4-苯基-2-四氫噁唑基	548
15 (實例8)	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-甲基-5-苯基-3-異噁唑基	518
16 (實例8)	L-1	X ¹	G-1	3a4,5,9b-四氫萘[2,1-d]異噁唑-3-基	530
17	L-1	X ¹	G-1	5-(3-氯苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基	538
18 (實例8)	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(4-甲氧苯基)-3-異噁唑基	534
19 (實例1)	L-2	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	518
20	L-3	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	504
21	L-4	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	491
22 (實例1)	L-5	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	558
23	L-6	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	460
24	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(苯基甲基)-3-異噁唑基	518
25	L-1	X ¹	G-1	(4R**,5S**)-4,5-二氫-4-甲基-5-苯基-3- 異噁唑基	518
26	L-1	X ¹	G-1	4-聯苯基	511
27	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(3-甲基丁基)-3-異噁唑基	498

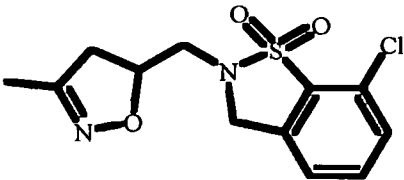
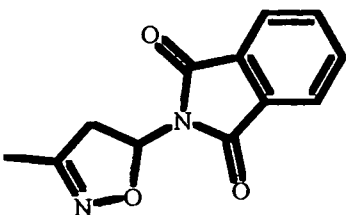
化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
28	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2,2-二甲基丙基)-3-異噁唑基	498
29	L-1	X ¹	G-1	5,6-二氫-6-甲基-6-苯基-4H-1,2-噁吡-3-基	532
30	L-1	X ¹	G-1	3-苯基-5-異噁唑基	502
31	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-4-苯基-2-噁唑基	504
32	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-1-(苯基甲基)-1H-咪唑-2-基	517
33	L-1	X ¹	G-27	3-聯苯基	494
34	L-1	X ¹	G-27	6-苯基-2-哌啶基	495
35	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基	572
36	L-1	X ¹	G-1	5-[3-(三氟甲基)苯基]-3-異噁唑基	570
37 (實例8)	L-1	X ¹	G-1		544
38	L-1	X ¹	G-1	5-(4-聯苯基)-3-異噁唑基	578
39	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(3,5-二氯苯基)-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基	640
40	L-1	X ¹	G-1	5-苯基-1,3,4-噁二唑-2-基	503
41	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-2-噁唑基	504
42	L-1	X ¹	G-1	5-苯基-2-噁唑基	502
43	L-1	X ¹	G-1	2-苯并噻唑基	492
44 (實例8)	L-1	X ¹	G-1		530
45	L-1	X ¹	G-1		511
46	L-1	X ¹	G-1	(4R)-4,5-二氫-4-苯基-2-噁唑基	504

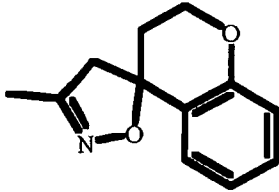
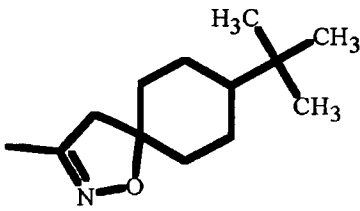
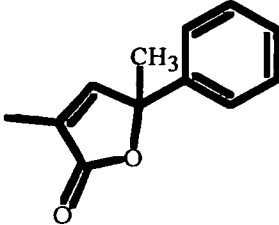
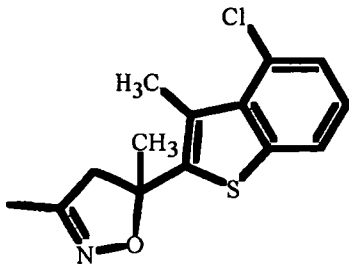
化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
47	L-1	X ¹	G-1	(5S)-4,5-二氫-5-苯基-2-噁唑基	504
48	L-1	X ¹	G-1	5,6-二氫-6-苯基-4H-1,3-噁吡-2-基	518
49	L-1	X ¹	G-1	(4S)-4,5-二氫-4-苯基-2-噁唑基	504
50	L-1	X ¹	G-1	(5R)-4,5-二氫-5-苯基-2-噁唑基	504
51	L-1	X ¹	G-1		516
52	L-1	X ¹	G-1	2-苯并噁唑基	475
53	L-1	X ¹	G-1	5,6-二氫-5-苯基-4H-1,3-噁吡-2-基	518
54	L-1	X ¹	G-1	5,6-二氫-4-苯基-4H-1,3-噁吡-2-基	518
55	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(甲氧羰基)-3-異噁唑基	486
56	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(1,1-二甲基乙基)-3-異噁唑基	484
57	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2-溴基乙基)-3-異噁唑基	534
58	L-1	X ¹	G-1	2-苯并咪唑基	475
59	L-1	X ¹	G-1	5-(2-氟苯基)-3-異噁唑基	520
60	L-1	X ¹	G-1	5-(2-三氟甲基苯基)-3-異噁唑基	570
61	L-1	X ¹	G-1	2-萘基	485
62	L-1	X ¹	G-1	苯基	435
63	L-7	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	518
64	L-1	X ¹	G-1	5-(2,4-二氟苯基)-3-異噁唑基	538
65	L-1	X ¹	G-1	1-苯基-2-四氫吡咯酮-4-基	518
66	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-氰基-3-異噁唑基	453
67	L-1	X ¹	G-1		482
68	L-1	X ¹	G-1	3-苯基-1,2,4-噁二唑-5-基	503
69	L-15	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	532
70	L-16	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	478
71	L-17	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	500

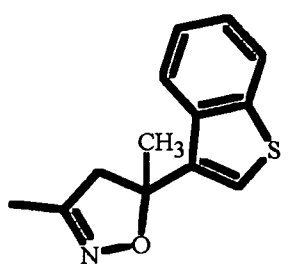
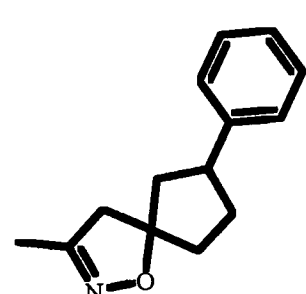
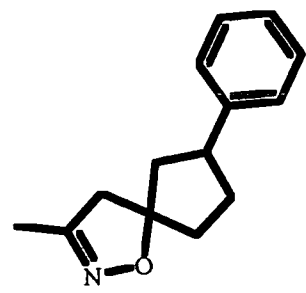
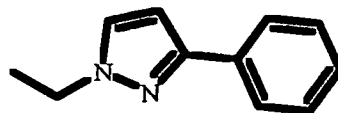


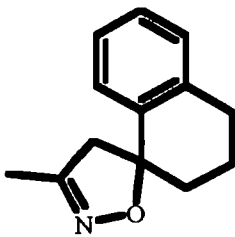
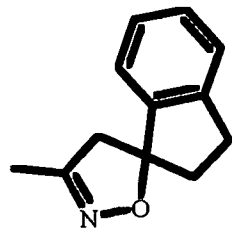
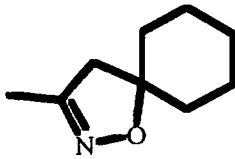
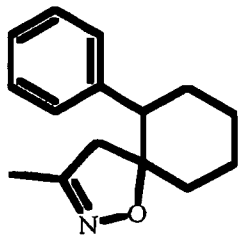
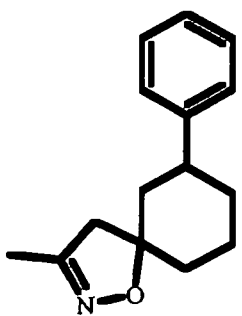
化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
72	L-1	X ¹	G-1	4-苯氧基苯基	527
73	L-1	X ¹	G-1	1-萘基	485
74	L-1	X ¹	G-1	3-聯苯基	511
75	L-1	X ¹	G-1	3-苯氧基苯基	527
76	L-1	X ¹	G-1	1-苯基吡唑-3-基	501
77	L-1	X ¹	G-1	1-(4-甲基苯基)-1,2,3-三唑-4-基	516
78	L-1	X ¹	G-1	1-苯基吡唑-5-基	501
79	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2-氟苯基)-3-異噁唑基	522
80	L-17	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2-氟苯基)-3-異噁唑基	518
81	L-1	X ¹	G-1	5,6-二氫-5-苯基-6-甲氧基-4H-1,2- 噁吡-3-基	548
82	L-1	X ¹	G-1		518
83	L-1	X ¹	G-1	5-苯基-2-呋喃基	501
84	L-1	X ¹	G-1	2-苯基-4-噻唑基	518
85	L-1	X ¹	G-1	5-苯基-2-噻吩基	517
86	L-1	X ¹	G-1	3-(2,4-二氯苯基)-5-異噁唑基	570
87	L-1	X ¹	G-1	3-(3,4-二氯苯基)-5-異噁唑基	570
88	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(萘-2-基)-3-異噁唑基	554
89	L-18	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	462
90	L-19	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	468
91	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(4-第三-丁基苯基)-3- 異噁唑基	560
92	L-1	X ¹	G-1	(5R)-4,5-二氫-5-苯基-1H-咪唑-2-基	503
93	L-8	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	450
94	L-9	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	478

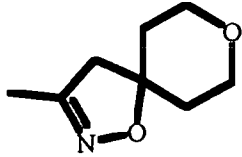
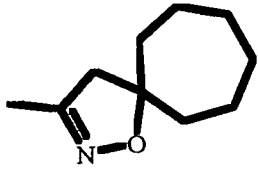
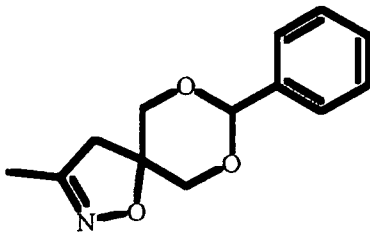
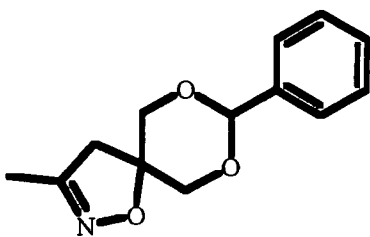
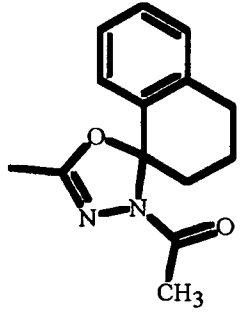
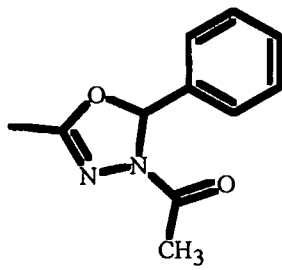
化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
95	L-1	X ¹	G-1		536
96	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(4-氟苯基)-3-異噁唑基	522
97	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(4-三氟甲基苯基)-3-異噁唑基	572
98 (實例9)	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2-哌啶基)-3-異噁唑基	505
99	L-1	X ¹	G-1		481
100	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-異丙基-5-苯基-3-異噁唑基	546
101	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-丙基-5-苯基-3-異噁唑基	546
102 (實例1)	L-1	X ¹	G-1		562
103	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-環丙基-5-苯基-3-異噁唑基	544
104	L-1	X ¹	G-1		572
105	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-乙基-5-苯基-3-異噁唑基	532
106	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(4-聯苯基)-3-異噁唑基	580
107 (實例10)	L-10	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	524
108	L-1	X ¹	G-1	(4R,5R)-4,5-二氫-4,5-二苯基-1H-咪唑-2-基	579
109	L-1	X ¹	G-1		550
110	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(4-羥苯基)-3-異噁唑基	520

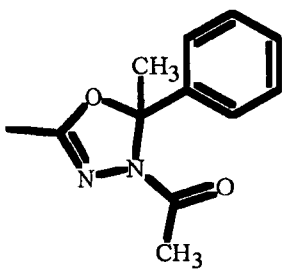
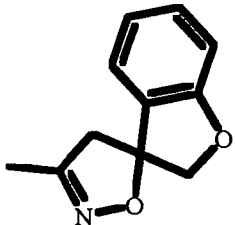
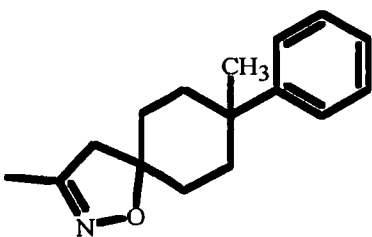
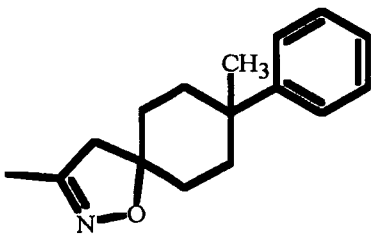
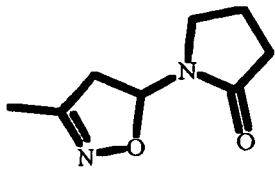
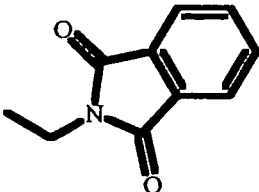
化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
111	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2-吡咩基)-3-異噁唑基	506
112	L-1	X ¹	G-1		643
113	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(4-乙醯氧基苯基)-3-異噁唑基	562
114	L-I	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2-三氟甲基苯基)-3-異噁唑基	572
115	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(3-三氟甲基苯基)-3-異噁唑基	572
116	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(甲氧羰基甲基)-3-異噁唑基	500
117	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(苯磺醯基)-3-異噁唑基	568
118	L-1	X ¹	G-1	(5R)-4,5-二氫-1-甲基-5-苯基-1H-咪唑-2-基	517
119	L-1	X ¹	G-1	(4S,5R)-4,5-二氫-4,5-二苯基-1H-咪唑-2-基	579
120	L-1	X ¹	G-1	4-氯苯基	469
121	L-1	X ¹	G-1	2-氯苯基	469
122	L-1	X ¹	G-1	4-(三氟甲基)苯基	503
123	L-1	X ¹	G-1	3-氯苯基	469
124	L-1	X ¹	G-1	3-哌啶基	436
125	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(3,4-二羥苯基)-3-異噁唑基	536
126 (實例11)	L-11	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	568
127	L-12	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	658
128 (實例1)	L-13	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	504
129	L-1	X ¹	G-1		573
130 (實例6)	L-14	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	520
131	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2-甲氧苯基)-3-異噁唑基	534
132	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-甲基-5-(2,5-二氯-3-噻吩基)-3-異噁唑基	592

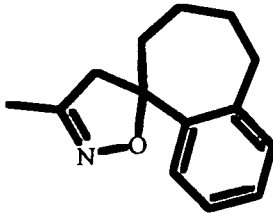
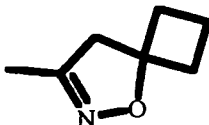
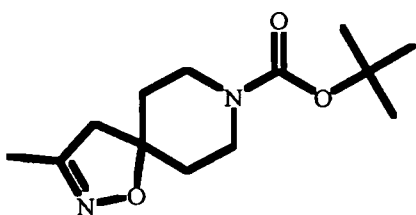
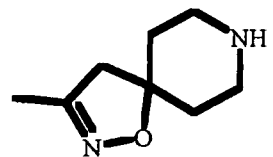
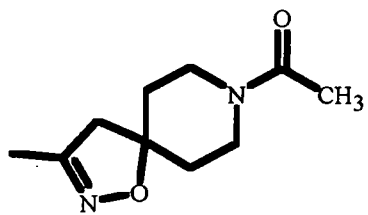
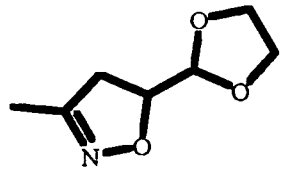
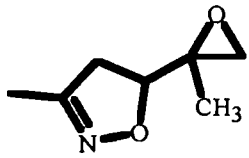
化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
133	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2,5-二甲基苯基)-3-異噁唑基	532
134	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(4-甲氧羰基苯基)-3-異噁唑基	562
135	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2,6-二氯苯基)-3-異噁唑基	572
136	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2,4-二甲基苯基)-3-異噁唑基	532
137 (實例1)	L-1	X ¹	G-1		546
138	L-1	X ¹	G-1		552
139	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5,5-二苯基-3-異噁唑基	580
140	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2-甲氧苯基)-5-甲基-3-異噁唑基	548
141	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(甲氧基甲基)-5-苯基-3-異噁唑基	548
142	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(甲硫基甲基)-5-苯基-3-異噁唑基	564
143	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(甲磺醯基甲基)-5-苯基-3-異噁唑基	596
144	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(甲基亞磺醯基甲基)-5-苯基-3-異噁唑基	580
145	L-1	X ¹	G-1		531
146	L-1	X ¹	G-1		622

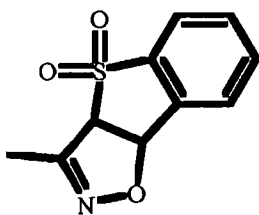
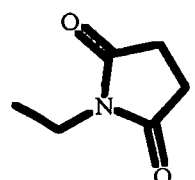
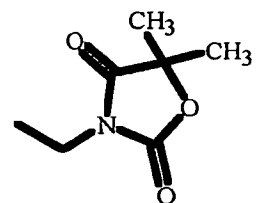
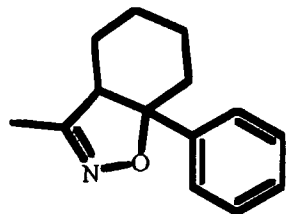
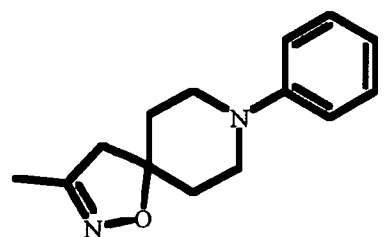
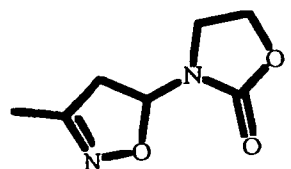
化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
147	L-1	X ¹	G-1		574
148	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(3-噻吩基)-3-異噁唑基	510
149	L-1	X ¹	G-1	3-甲基苯基	449
150	L-1	X ¹	G-1	4-甲氧苯基	465
151	L-1	X ¹	G-1	4-甲基苯基	449
152	L-1	X ¹	G-1	3-甲氧苯基	465
153	L-1	X ¹	G-1	2-甲氧苯基	465
154 (實例7)	L-1	X ²	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	505
155	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2,4,6-三甲氧基苯基)-3-異噁唑基	594
156	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-乙醯氧基甲基-5-苯基-3-異噁唑基	576
157	L-1	X ¹	G-1	 [註3]	558
158	L-1	X ¹	G-1	 [註4]	558
159	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-羥甲基-5-苯基-3-異噁唑基	534
160	L-1	X ¹	G-1		515
161	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2-甲基苯基)-3-異噁唑基	518

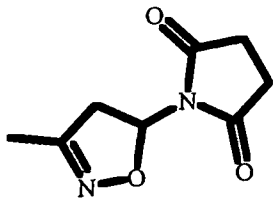
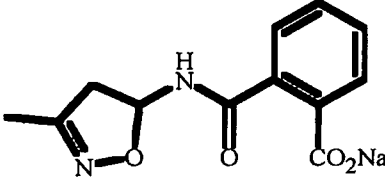
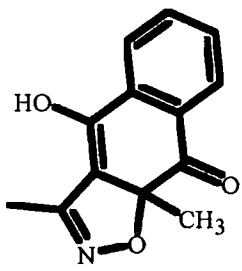
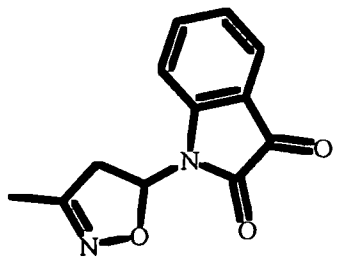
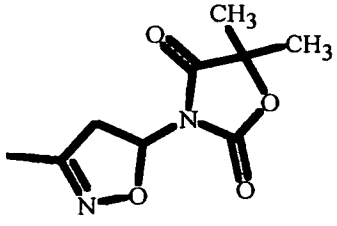
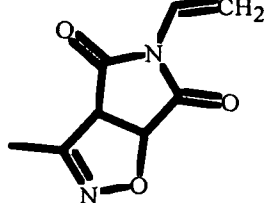
化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
162	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-噻吩-2-基-3-異噁唑基	510
163	L-8	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-甲基-5-苯基-3-異噁唑基	464
164	L-8	X ¹	G-1		490
165	L-8	X ¹	G-1		476
166	L-20	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	490
167	L-21	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	647
168	L-23	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	579
169	L-1	X ¹	G-1		496
170	L-1	X ¹	G-1	 [註5]	572
171	L-1	X ¹	G-1	 [註5]	572
172	L-24	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	562

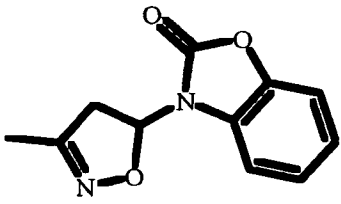
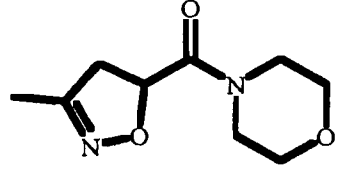
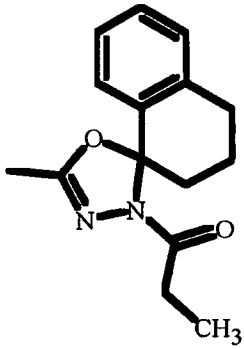
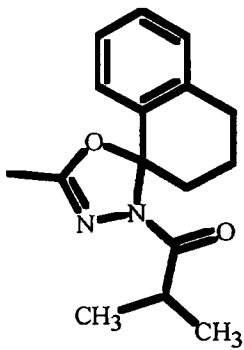
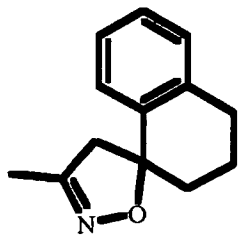
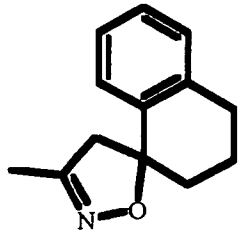
化合物	L	X ¹	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
173	L-1	X ¹	G-1		498
174	L-1	X ¹	G-1		510
175	L-1	X ¹	G-1	 [註3]	576
176	L-1	X ¹	G-1	 [註4]	576
177	L-1	X ¹	G-1		587
178	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2,6-二甲基苯基)-3-異噁唑基	532
179	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2,4,6-三甲基苯基)-3-異噁唑基	546
180	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-哌啶-4-基-3-異噁唑基	505
181	L-1	X ¹	G-1		547

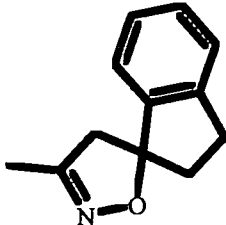
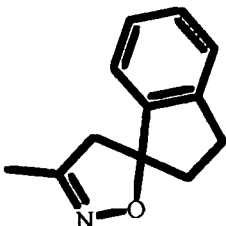
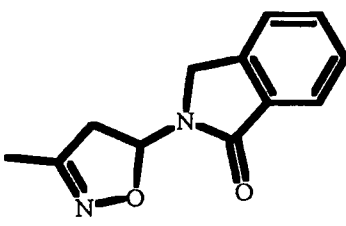
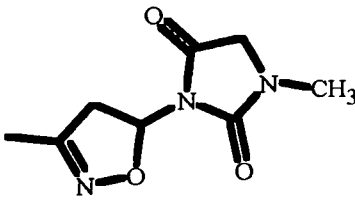
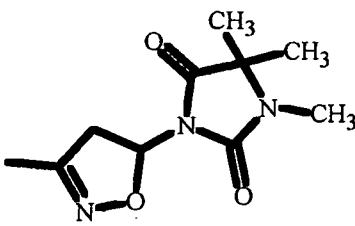
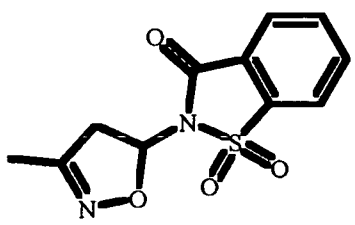
化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
182	L-1	X ¹	G-1		561
183	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-1H-吡唑-3-基	503
184	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-(1-甲基-1H-吡唑-3-基)	517
185	L-1	X ¹	G-1		532
186	L-1	X ¹	G-1	 [註 3]	586
187	L-1	X ¹	G-1	 [註 4]	586
188	L-1	X ¹	G-1		511
189	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2-溴苯基)-3-異噁唑基	582
190	L-26	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	524
191	L-1	X ¹	G-1		518

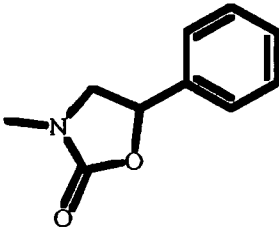
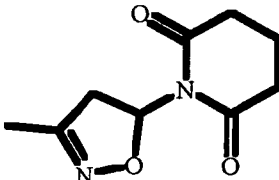
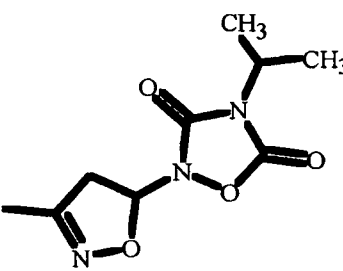
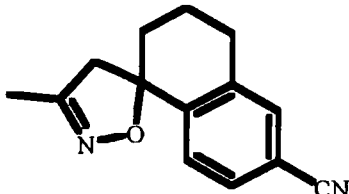
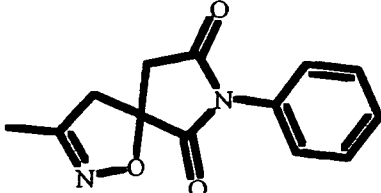
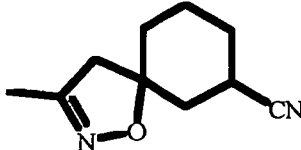
化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
192	L-1	X ¹	G-1		558
193	L-1	X ¹	G-1		468
194	L-1	X ¹	G-1		597
195	L-1	X ¹	G-1		497
196	L-1	X ¹	G-1		539
197	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-(1-乙醯基-1H-吡唑-3-基)	545
198	L-28	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	524
199	L-1	X ¹	G-1		500
200	L-1	X ¹	G-1		484
201	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(4-甲基噻唑-5-基)-3-異噁唑基	525

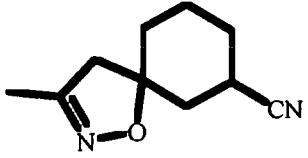
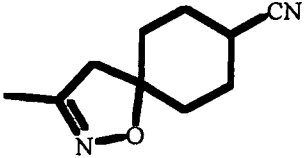
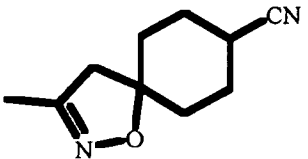
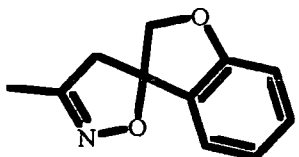
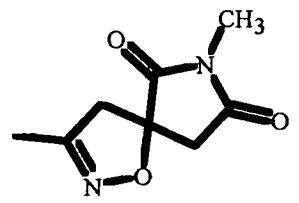
化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
202	L-1	X ¹	G-1		566
203	L-1	X ¹	G-1	3-異噁唑基	425
204	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯氧基-3-異噁唑基	520
205	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-甲基-5-(2-甲基苯基)-3-異噁唑基	532
206	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2,6-二甲氧基苯基)-3-異噁唑基	564
207	L-1	X ¹	G-1		469
208	L-1	X ¹	G-1		500
209	L-1	X ¹	G-1		558
210	L-1	X ¹	G-1	5-(2-羥羰基苯基)-3-異噁唑基	546
211	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(1,1-二甲基乙氧基)-3-異噁唑基	500
212	L-1	X ¹	G-1		573
213	L-1	X ¹	G-1		513

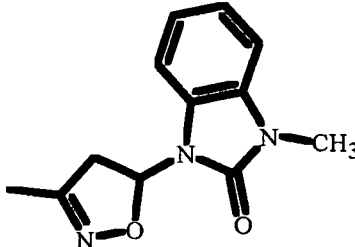
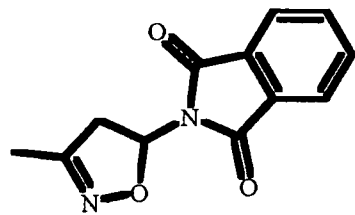
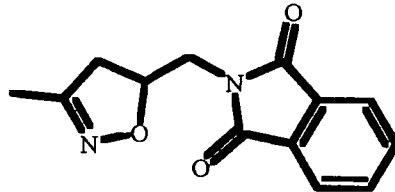
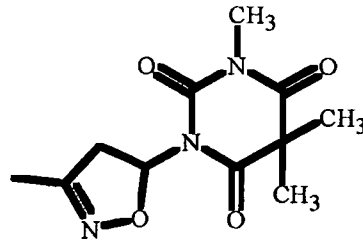
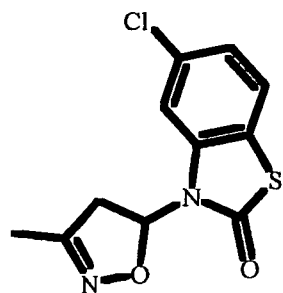
化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
214	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2,6-二氟苯基-3-異噁唑基	540
215	L-1	X ¹	G-1		525
216	L-1	X ¹	G-1		613
217 (實例13)	L-1	X ³	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	502
218	L-1	X ¹	G-1		572
219	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(1-甲基苯并咪唑-2-基)-3-異噁唑基	558
220	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2-氰基苯基)-3-異噁唑基	529
221	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-2-甲氧羰基苯基)-3-異噁唑基	562
222	L-1	X ¹	G-1		573
223	L-1	X ¹	G-1		555
224	L-1	X ¹	G-1		523

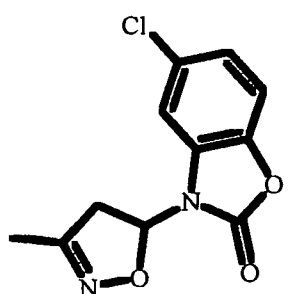
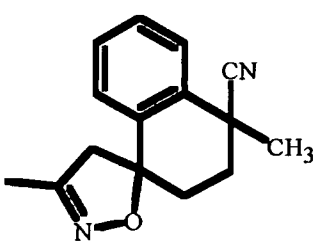
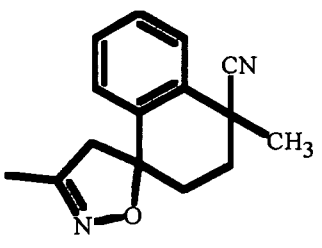
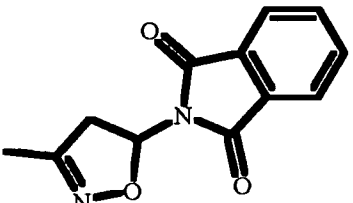
化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
225	L-1	X ¹	G-1		561
226	L-1	X ¹	G-1		541
227	L-1	X ¹	G-1		601
228	L-1	X ¹	G-1		615
229	L-5	X ¹	G-1		598
230	L-10	X ¹	G-1		564

化合物	L	X ¹	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
231	L-5	X ¹	G-1		584
232	L-10	X ¹	G-1		550
233	L-1	X ¹	G-1		559
234	L-1	X ¹	G-1		540
235	L-1	X ¹	G-1		568
236	L-1	X ¹	G-1		609
237	L-29	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	508
238	L-30	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	508
239	L-31	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	566
240	L-32	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	562
241	L-33	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	534

化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
242	L-1	X ¹	G-1		520
243	L-1	X ¹	G-1		539
244	L-1	X ¹	G-1		570
245	L-1	X ¹	G-1	4-氟苯基	453
246	L-1	X ¹	G-1	4-第三-丁基苯基	491
247	L-1	X ¹	G-1	4-氰基苯基	460
248	L-1	X ¹	G-1	4-硝基苯基	480
249	L-1	X ¹	G-1	4-溴苯基	513
250	L-1	X ¹	G-1	4-碘苯基	561
251	L-1	X ¹	G-1		569
252	L-1	X ¹	G-1		587
253	L-1	X ¹	G-1	 [註3]	521

化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
254	L-1	X ¹	G-1	 [註4]	521
255	L-1	X ¹	G-1	 [註3]	521
256	L-1	X ¹	G-1	 [註4]	521
257	L-22	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	506
258	L-25	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	556
259	L-27	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-苯基-3-異噁唑基	520
260	L-5	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-甲基-5-苯基-3-異噁唑基	572
261	L-10	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-甲基-5-苯基-3-異噁唑基	538
262	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2-胺基磺醯基苄基)-3-異噁唑基	597
263	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2-乙醯氧基苯基)-3-異噁唑基	562
264	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(N-甲基-N-苯基羰基胺基)-3-異噁唑基	561
265	L-1	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-氰基-5-苯基-3-異噁唑基	529
266	L-8	X ¹	G-1		478
267	L-1	X ¹	G-1		525
268	L-1	X ¹	G-1	4-乙基苯基	463
269	L-1	X ¹	G-1	4-三氟甲氧基苯基	519

化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
270	L-1	X ¹	G-1	4-甲氧羰基苯基	493
271	L-1	X ¹	G-1	4-丙基苯基	477
272	L-1	X ¹	G-1	4-甲基硫苯基	481
273	L-1	X ¹	G-1	4-異丙基苯基	477
274	L-1	X ¹	G-1	4-異丁基苯基	491
275	L-1	X ¹	G-1		574
276	L-5	X ¹	G-1		627
277	L-8	X ¹	G-1	4,5-二氫-5-(2,4,6-三甲氧基苯基)-3-異噁唑基	540
278	L-1	X ¹	G-1		587
279	L-1	X ¹	G-1		596
280	L-1	X ¹	G-1		611

化合物	L	X	G	Z ₁ -J	AP ⁺ (M+1)
281	L-1	X ¹	G-1		595
282	L-1	X ¹	G-1	 [註 3]	583
283	L-1	X ¹	G-1	 [註 4]	583
284	L-8	X ¹	G-1		519

[註 1]: 自 CHIRALPAK[®] AD-RH 管柱，使用水中之甲醇作為溶離劑，較快速溶離之對掌異構物，旋光率 = -98.8°。使用分析 CHIRALPAK[®] AD-RH 管柱之分析，顯示約 100% 光學純度。

5 [註 2]: 自 CHIRALPAK[®] AD-RH 逆相管柱，使用水中之甲醇作為溶離劑，較緩慢溶離之對掌異構物，旋光率 = +88°。使用分析 CHIRALPAK[®] AD-RH 管柱之分析，顯示約 93% 光學純度。

[註 3]: 非對映異構物 A。

[註4]：非對映異構物B。

[註5]：異構物之混合物。

本發明之生物學實例

關於製備試驗A-C用之待測懸浮液之一般擬案：首先使待
5 測化合物溶於其量等於最後體積3%之丙酮中，然後，在所
要之濃度(以ppm)下，懸浮於含有250 ppm界面活性劑Trem®
014(多羥醇酯類)之丙酮與純水(50/50混合體積比)中。所形
成之待測懸浮液係接著使用於試驗A-C中。將200 ppm待測
懸浮液噴霧至待測植物上，達流出點，係相當於500克/公
10 頃之比率。

試驗A

將葡萄籽苗以葡萄生單軸霉(葡萄絨毛白粉病之病因劑)
之孢子懸浮液接種，並於飽和大氣中，在20°C下培養24小
時。在短乾燥期之後，將待測懸浮液噴霧至葡萄籽苗上至
15 流出點，然後，移至生長室，於20°C下歷經5天，接著將待
測單元放回飽和大氣中，於20°C下歷經24小時。在移除時，
施行疾病分等級。

試驗B

將待測懸浮液噴霧至番茄籽苗上至流出點。隔天，將籽
20 苗以致病疫霉(番茄晚疫病之病因劑)之孢子懸浮液接種，
並於飽和大氣中，在20°C下培養24小時，然後，移至生長
室，於20°C下歷經5天，接著施行疾病分等級。

試驗C

將番茄籽苗以致病疫霉(番茄晚疫病之病因劑)之孢子懸

浮液接種，並於飽和大氣中，在 20°C 下培養 17 小時。在短乾燥期之後，將待測懸浮液噴霧至番茄籽苗上至流出點，然後，移至生長室，於 20°C 下歷經 4 天，接著施行疾病分等級。

- 5 除了試驗 A-C 以外，化合物亦被噴塗在 2 個各別組上，在處理後 24 小時，以灰葡萄孢或茄鏈格孢接種之番茄植物，在處理後 24 小時，以瓜果腐霉接種之莓繫屬牧草植物，及 3 個各別組，在處理後 24 小時，以禾白粉菌小麥物種、隱匿柄銹菌或穎枯殼針孢接種之小麥植物。待測化合物無法有效抵抗此等其他病原。

試驗 A-C 之結果係示於表 A 中。在此表中，100 之等級表示 100% 疾病控制，而 0 之等級表示無疾病控制(相對於對照組)。破折號(-)表示沒有試驗結果。

表 A

生物學試驗之結果

疾病控制百分比			
化合物	試驗A	試驗B	試驗C
1	100	100	99
3**	100	100	99
4**	100	100	99
5	96	100	99
6*	95	100	99
7	0	93	59
8	100	100	99
9	99	100	99
10	97	100	99
11	99	100	99
12	52	47	0
13	0	95	86
14	25	99	99
15	100	100	98
16	99	100	99
17*	100	99	99
18*	100	100	99
19*	100	100	99
20*	96	99	99
21*	46	50	7
22*	100	100	99
23*	99	100	99
24	99	100	93
25*	100	100	99
26	76	83	33
27	100	100	98
28	99	100	94
29	99	100	99
30**	31	57	50
31**	84	83	60
32	0	26	0
33	15	9	0
34	0	40	0
*	100	100	96
36	58	57	24
37*	100	100	99
38	0	9	0

疾病控制百分比			
化合物	試驗A	試驗B	試驗C
2	100	99	99
39	8	67	0
40	47	100	99
41	0	100	99
42	62	100	96
43	0	43	0
44*	100	100	99
45	30	26	0
46	0	99	53
47	0	85	47
48	0	85	0
49	0	100	96
50	0	100	99
51	99	100	99
52	85	100	67
53*	24	68	26
54	16	73	0
55	17	26	0
56	99	100	99
57	99	100	99
58	0	99	0
59*	97	100	91
60	100	95	94
61	80	77	0
62	73	73	26
63	80	100	98
64	90	99	88
65	46	100	83
66	48	63	73
67*	100	100	99
68	96	95	88
69	40	9	0
70	8	24	0
71	-	99	33
72	72	100	52
73	27	40	0
74	50	40	0

疾病控制百分比			
化合物	試驗A	試驗B	試驗C
75	72	24	0
76	72	92	67
77	87	100	99
78	0	0	0
79	100	100	66
80	99	100	57
81	93	92	77
82	0	88	26
83	46	92	0
84	67	33	0
85	85	70	0
86	83	79	14
87	76	44	0
88*	99	100	99
89	49	73	0
90	66	57	0
91*	99	100	91
92*	13	33	9
93*	78	100	99
94*	99	100	99
95*	100	100	95
96*	100	100	99
97*	99	100	95
98*	77	100	99
99	31	33	0
100*	100	100	99
101*	100	100	99
102*	100	100	99
103*	100	100	99
104	100	100	99
105*	100	100	99
106*	80	85	24
107*	100	100	99
108	0	58	0
109*	100	100	98
110*	97	100	99

疾病控制百分比			
化合物	試驗A	試驗B	試驗C
111*	97	100	97
112*	76	100	68
113*	99	100	99
114*	100	100	99
115*	100	100	99
116	46	100	79
117*	93	100	99
118*	0	87	16
119	0	82	0
120	99	88	0
121	83	47	0
122	99	46	0
123	95	68	0
124	8	98	26
125	31	53	0
126	100	100	99
127	73	40	0
128*	100	100	99
129*	99	100	99
130**	100	100	99
131*	100	100	99
132*	85	100	91
133*	100	100	99
134*	90	100	66
135*	100	100	99
136*	99	100	99
137*	100	100	99
138*	93	100	99
139*	87	98	87
140*	98	100	57
141*	99	100	99
142*	97	100	98
143*	99	100	99
144*	99	100	93
145	17	58	0
146	83	100	53

疾病控制百分比			
化合物	試驗A	試驗B	試驗C
147*	100	100	95
148**	100	100	99
149	99	97	-
150	99	100	-
151	100	99	-
152	91	89	-
153	73	0	-
154*	90	100	99
155*	100	100	99
156*	100	100	99
157*	100	100	94
158	96	100	99
159	94	100	99
160	68	80	17
161*	100	100	99
162*	100	100	99
163**	99	100	98
164**	99	100	99
165**	99	100	99
166**	100	100	98
167	67	64	24
168**	100	100	99
169	100	100	99
170*	99	100	93
171*	99	100	98
172*	91	63	0
173*	100	100	99
174*	100	100	99
175	68	100	33
176	68	100	63
177*	93	100	99
178*	100	100	99
179*	99	100	98
180	50	100	99
181	80	100	97
182	99	100	97

疾病控制百分比			
化合物	試驗A	試驗B	試驗C
183*	92	92	33
184*	99	95	73
185*	100	100	98
186*	95	100	86
187*	99	100	93
188*	99	100	99
189*	100	100	99
190	80	68	17
191	99	100	99
192*	99	100	99
193*	100	100	99
194*	94	100	99
195	48	92	80
196*	99	100	99
197*	89	100	90
198*	100	100	99
199	91	99	98
200	80	100	90
201*	99	100	99
202	95	100	98
203*	99	100	92
204*	99	100	99
205*	99	100	99
206*	99	100	99
207	40	83	0
208	79	64	0
209*	99	100	90
210	91	100	83
211*	100	100	99
212*	98	100	99
213*	94	100	98
214*	100	100	99
215*	99	100	99
216*	100	100	99
217*	95	100	99
218*	73	63	47

疾病控制百分比				疾病控制百分比			
化合物	試驗A	試驗B	試驗C	化合物	試驗A	試驗B	試驗C
219	100	100	99	253*	100	100	95
220	100	100	99	254*	100	100	93
221	100	100	99	255*	95	100	93
222	100	100	100	256*	100	100	99
223	100	100	100	257*	17	0	0
224	0	63	0	258**	100	100	98
225	100	100	100	259*	100	100	99
226	83	100	99	260**	100	100	96
227	100	100	100	261**	100	100	93
228	99	100	100	262*	79	100	91
229**	100	100	100	263*	99	84	83
230**	100	100	100	264*	99	100	88
231**	100	100	100	265**	100	100	98
232**	100	100	100	266*	100	100	100
233*	100	100	100	267	100	100	100
234*	99	100	100	268	100	100	88
235*	99	100	100	269	100	100	0
236*	100	100	100	270	99	83	0
237*	22	47	16	271	100	100	72
238*	100	100	100	272	100	100	100
239*	14	0	0	273	100	100	90
240*	100	100	100	274	99	100	100
241*	100	100	100	275**	99	100	98
242*	99	100	85	276**	100	100	97
243**	99	100	100	277*	86	100	99
244*	98	100	99	278*	94	100	99
245*	99	74	0	279*	100	100	99
246*	99	79	40	280**	92	100	98
247*	99	100	88	281**	100	100	99
248*	90	73	26	282	-	-	-
249*	99	64	0	283	-	-	-
250*	86	58	0	284	-	-	-
251*	99	100	99				
252*	88	91	97				

* 表示在 40 ppm 下測試之化合物。

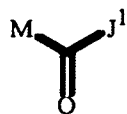
** 表示在 10 ppm 下測試之化合物。

【符號說明】

無

申請專利範圍

1. 一種選自式 1C 之化合物、該化合物之 N-氧化物、及該化合物或該 N-氧化物之鹽類，



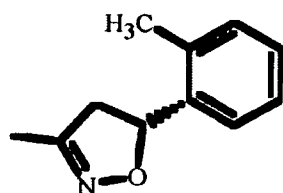
1C

5 其中

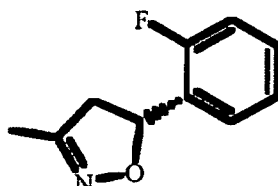
M 為 C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 鹵烷基、羥基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₂ 鹵烷氧基、C₁-C₄ 烷基胺基、C₂-C₈ 二烷基胺基、1-六氫吡啶基、1-四氫吡咯基或 4-嗎福啉基；且

J¹ 為

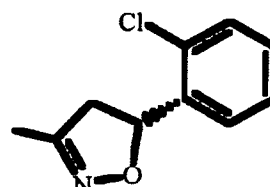
10



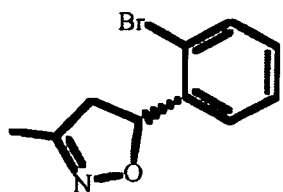
J-29-1



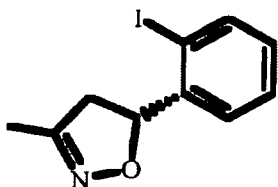
J-29-2



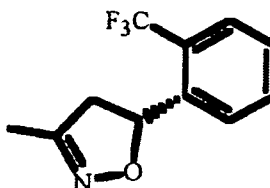
J-29-3



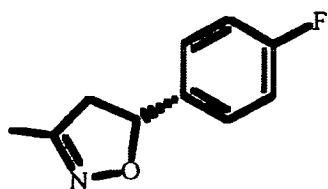
J-29-4



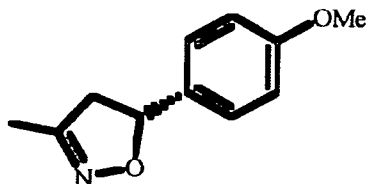
J-29-5



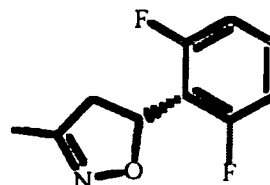
J-29-6



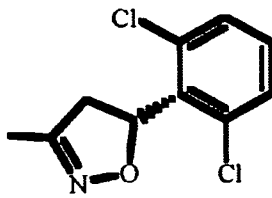
J-29-7



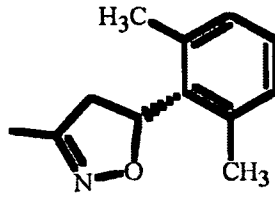
J-29-8



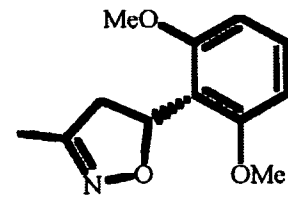
J-29-9



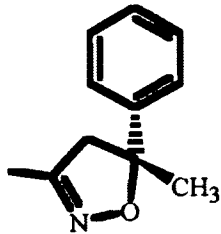
J-29-10



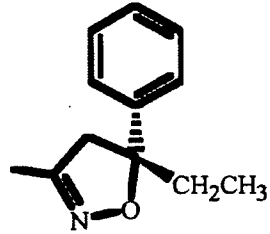
J-29-11



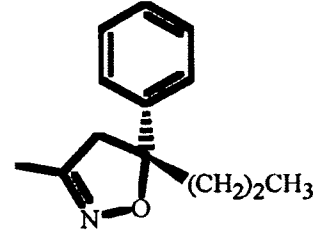
J-29-12



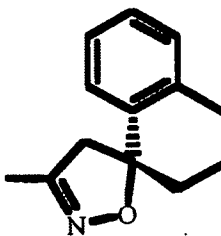
J-29-13



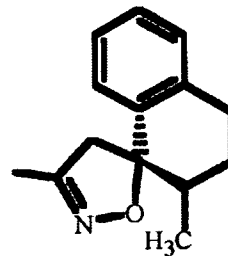
J-29-14



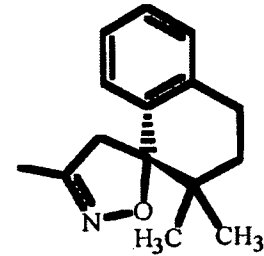
J-29-15



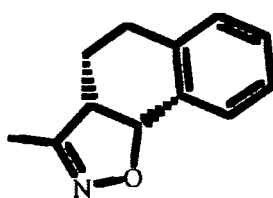
J-29-16



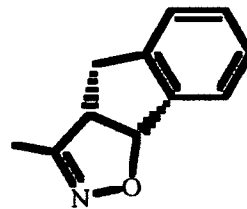
J-29-17



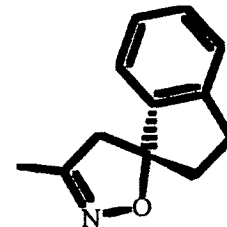
J-29-18



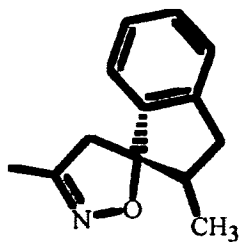
J-29-19



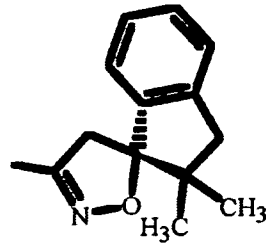
J-29-20



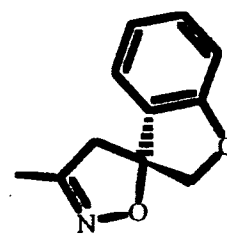
J-29-21



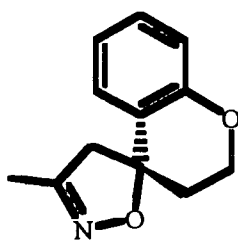
J-29-22



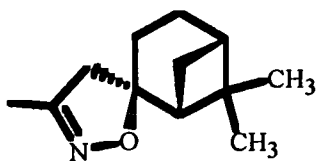
J-29-23



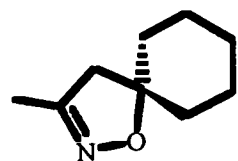
J-29-24



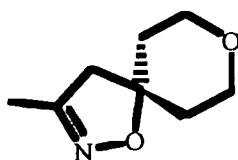
J-29-25



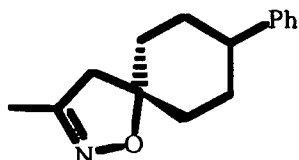
J-29-26



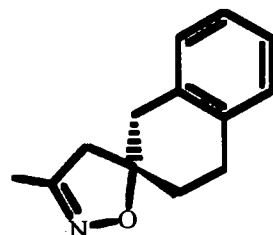
J-29-27



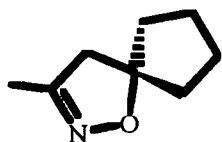
J-29-28



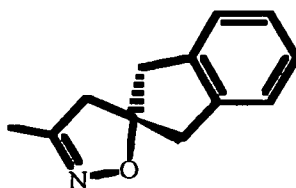
J-29-29



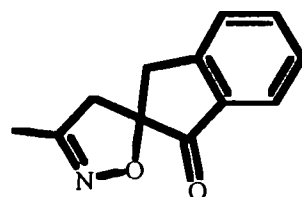
J-29-30



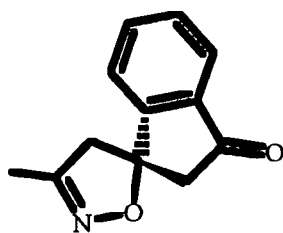
J-29-31



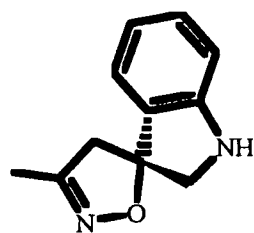
J-29-32



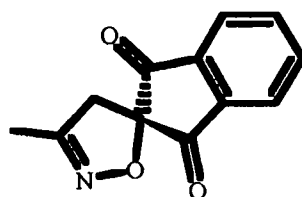
J-29-33



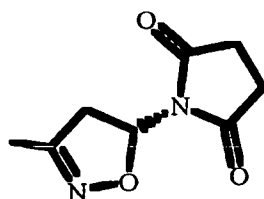
J-29-34



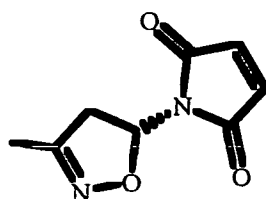
J-29-35



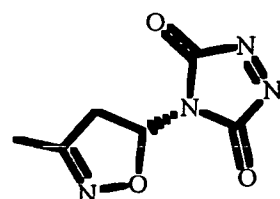
J-29-36



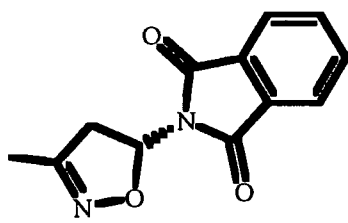
J-29-37



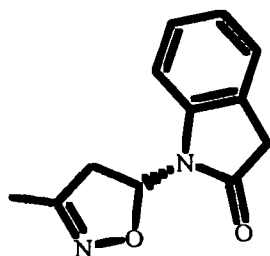
J-29-38



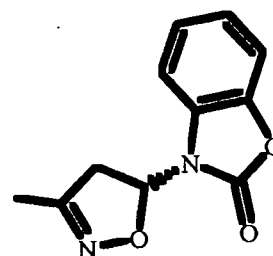
J-29-39



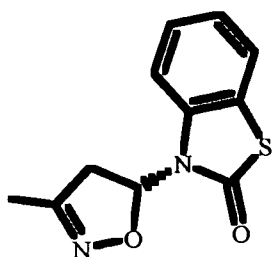
J-29-40



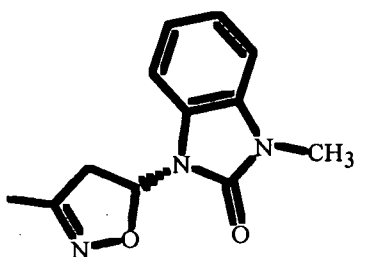
J-29-41



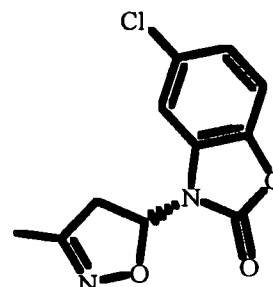
J-29-42



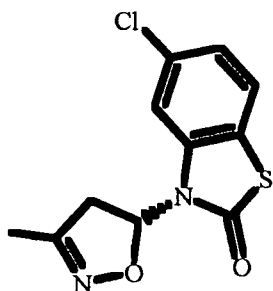
J-29-43



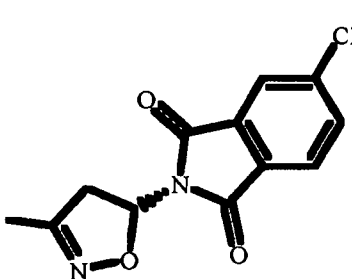
J-29-44



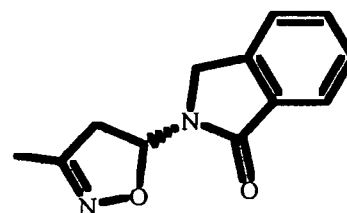
J-29-45



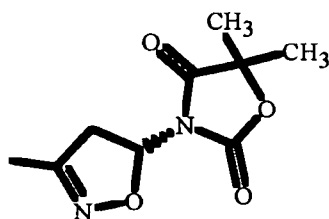
J-29-46



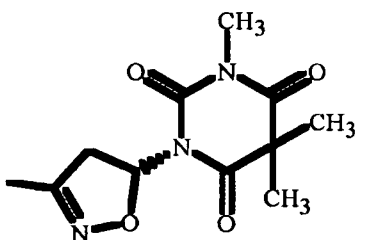
J-29-47



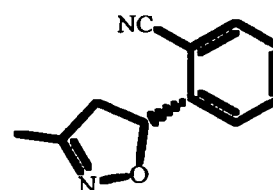
J-29-48



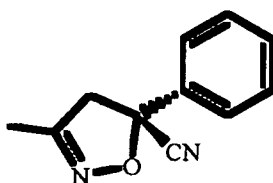
J-29-49



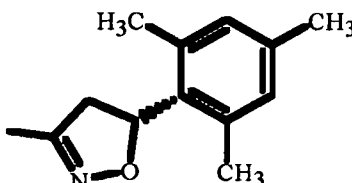
J-29-50



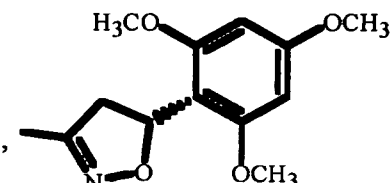
J-29-51



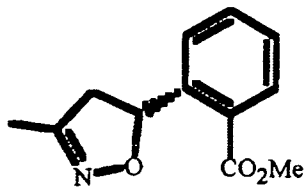
J-29-52



J-29-53

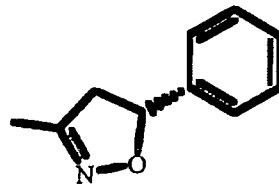


J-29-54



J-29-55

或

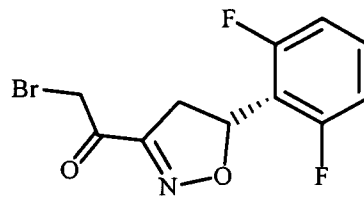
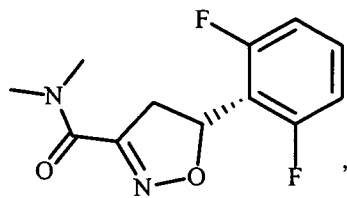


J-29-58

;

其條件是：該化合物並非 1-[(5R)-(4,5-二氫 -5-苯基 -3-異噁唑基)]-乙酮。

2.如請求項第1項所述之化合物、該化合物之N-氧化物及該化合物或該N-氧化物之鹽類，其中該化合物係選自：



或

