

發明專利說明書 200412847

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號： 92128889

※申請日期： 92-10-17

※IPC 分類： B01N 43/04
C07D 307/00

壹、發明名稱：(中文/英文)

化學化合物

CHEMICAL COMPOUNDS

貳、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

瑞士商諾華國際作物公司

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

代表人：(中文/英文)

瑪格麗特 安 魯德

MARGARET ANN RUDD

住居所或營業所地址：(中文/英文)

瑞士貝斯爾市雪瓦爾達伊路 215 號

SCHWARZWALDALLEE 215, CH-4058, BASEL, SWITZERLAND

國 籍：(中文/英文)

瑞士 SWITZERLAND

參、發明人：(共 3 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 喬塞夫 安洛恩佛伊德
JOSEF EHRENFREUND
2. 漢斯 泰博勒
HANS TOBLER
3. 哈拉德 華特
HARALD WALTER

住居所地址：(中文/英文)

1. 瑞士貝斯爾市雪瓦爾達伊路 215 號
SCHWARZWALDALLEE 215, CH-4058, BASEL,
SWITZERLAND
2. 瑞士貝斯爾市雪瓦爾達伊路 215 號
SCHWARZWALDALLEE 215, CH-4058, BASEL,
SWITZERLAND
3. 瑞士貝斯爾市雪瓦爾達伊路 215 號
SCHWARZWALDALLEE 215, CH-4058, BASEL,
SWITZERLAND

國 籍：(中文/英文)

1. 奧地利 AUSTRIA
2. 瑞士 SWITZERLAND
3. 德國 GERMANY

肆、聲明事項：

本案係符合專利法第二十條第一項第一款但書或第二款但書規定之期間，其日期為： 年 月 日。

本案申請前已向下列國家(地區)申請專利：

1.英國；2002年10月18日；0224316.0

2.

3.

4.

5.

主張國際優先權(專利法第二十四條)：

【格式請依：受理國家(地區)；申請日；申請案號數 順序註記】

1.英國；2002年10月18日；0224316.0

2.

3.

4.

5.

主張國內優先權(專利法第二十五條之一)：

【格式請依：申請日；申請案號數 順序註記】

1.

2.

3.

主張專利法第二十六條微生物：

國內微生物 【格式請依：寄存機構；日期；號碼 順序註記】

國外微生物 【格式請依：寄存國名；機構；日期；號碼 順序註記】

熟習該項技術者易於獲得，不須寄存。

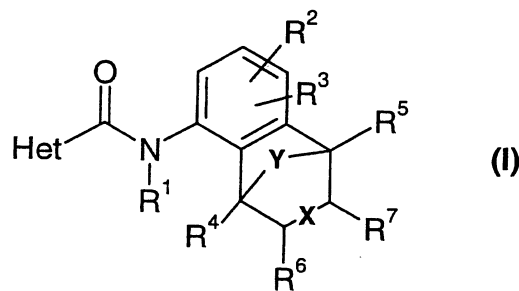
玖、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係有關具有殺微生物活性特別殺真菌活性之新穎參環胺衍生物。本發明亦係關於此等化合物之製備，用於製備此等化合物之新穎中間物，包含至少一種新穎化合物作為活性成分之農業化學組合物，所述組合物之製備以及活性成分或組合物用於農藝或園藝控制或預防植物受植物病原性微生物特別真菌的侵擾之用途。

【發明內容】

本發明提供一種式(I)化合物：



此處Het為含1至3個各自分別選自氧、氮及硫之雜原子之5-員或6-員雜環族環，但該環非為1,2,3-三唑，該環經以 R^8 、 R^9 及 R^{10} 基團取代；X為單鍵或雙鍵；Y為O、S、N(R^{11})或 $(CR^{12}R^{13})(CR^{14}R^{15})_m(CR^{16}R^{17})_n$ ；m為0或1；n為0或1； R^1 為氫、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、 $CH_2C=CR^{18}$ 、 $CH_2CR^{19}=CHR^{20}$ 、 $CH=C=CH_2$ 或 COR^{21} ； R^2 及 R^3 各自分別為氫、鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基或 C_{1-4} 鹵烷氧基； R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 各自分別為氫、鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4}

鹵烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{1-4} 鹵烷硫基、羥基甲基、 C_{1-4} 烷氧基甲基、 $C(O)CH_3$ 或 $C(O)OCH_3$ ； R^8 、 R^9 及 R^{10} 各自分別為氫、鹵素、氰基、硝基、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})伸烷基或 C_{1-4} 鹵烷氧基(C_{1-4})伸烷基，但 R^8 、 R^9 及 R^{10} 中之至少一者非為氫； R^{11} 為氫、 C_{1-4} 烷基、苄基(其中該苄基選擇性經以至多3個取代基取代，取代基各自分別係選自鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基以及 C_{1-4} 烷氧基)、甲醯基、 $C(O)C_{1-4}$ 烷基(選擇性經以鹵素或 C_{1-4} 烷氧基取代)、 $C(O)OC_{1-6}$ 烷基(選擇性經以鹵素、 C_{1-4} 烷氧基或氰基取代)或 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})伸烷基； R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 及 R^{17} 各自分別為氫、鹵素、羥基、 C_{1-6} 烷基、 C_{2-6} 烯基[二者選擇性經以鹵素、羥基、 C_{1-4} 烷氧基、 $=O$ 、芳基或 $O-C(O)-C_{1-4}$ 烷基或3-7員羧酸環(其本身選擇性經以至多3個甲基取代)取代]、3-7員飽和環(選擇性經以以至多3個甲基取代，選擇性含有一個選自氮及氧之雜原子)或 C_{1-4} 烷氧基；或 R^{12} 及 R^{13} 與其附接之碳原子共同形成 $C=O$ 基團或3-5員碳環系環(選擇性經以至多3個甲基取代，且選擇性經含有至多2個各自分別選自O及N之雜原子)；或 R^{12} 及 R^{13} 共同形成一個 C_{1-6} 亞烷基(選擇性經以至多3個甲基取代)或一個 C_{3-6} 亞環烷基(選擇性經以至多3個甲基取代)； R^{18} 、 R^{19} 及 R^{20} 各自分別為氫、鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基或 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})伸烷基；以及 R^{21} 為氫、 C_{1-6} 烷基、 C_{1-6} 鹵烷基、 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})伸烷基、 C_{1-4} 烷基-S-(C_{1-4})伸烷基、 C_{1-4} 烷氧基或芳基。

鹵素為氟、氯、溴或碘；較佳為氟、氯或溴。

各個烷基部分為直鏈或分支鏈，例如為甲基、乙基、正丙基、正丁基、正戊基、正己基、異丙基、第二丁基、異丁基、第三丁基、新戊基、正庚基、1,3-二甲基丁基、1,3-二甲基戊基、1-甲基-3-乙基-丁基或1,3,3-三甲基丁基。同理，各個伸烷基部分為直鏈或分支鏈。

鹵烷基部分為經以一或多個相同或相異之鹵原子取代之烷基部分，且為例如 CF_3 、 CF_2Cl 、 CHF_2 、 CH_2F 、 CCl_3 、 CF_3CH_2 、 CHF_2CH_2 、 CH_2FCH_2 、 CH_3CHF 或 CH_3CF_2 。

烯基及炔基部分可呈直鏈或分支鏈形式。

各個烯基部分於適當時可為(E)-組態或(Z)-組態。

3-5員碳環系環包括螺-三員或五員環。

芳基包括苯基、萘基、蒽基、芴基以及四氫茚基，但較佳為苯基。

亞烷基部分可呈直鏈或分支鏈形式。亞烷基包括亞甲基 $[\text{CH}_2=]$ 、亞乙基 $[\text{CH}_3\text{C}(\text{H})=]$ 、亞正丙基、亞異丙基、 $[(\text{CH}_3)_2\text{C}=]$ 、亞正丁基、亞異丁基、亞2-丁基、亞正戊基、亞異戊基、亞新戊基、亞2-戊基、亞正己基、亞2-己基、亞3-己基、亞異己基及亞新己基。

環烷基包括環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基及環辛基。

環烯基包括環丁烯基、環戊烯基、環己烯基及環庚烯基。

亞環烷基包括亞環丙基 $[\text{c}(\text{C}_3\text{H}_4)=]$ 、亞環丁基、亞環戊基及亞環己基。

於本發明之一方面， R^{11} 為氫、 C_{1-4} 烷基、苄基(其中苯基選擇性經以至多3個取代基取代，各個取代基分別係選自鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基以及 C_{1-4} 烷氧基)、甲醯基、 $C(O)C_{1-4}$ 烷基或 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})伸烷基。

於本發明之另一方面， R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 及 R^{17} 各自分別為氫、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基。

Het較佳為吡咯基、吡唑基、噻唑基、呋唑基、吡啶基、嘧啶基、嗒吡基、嗒吡基、2,3-二氫-[1,4]氧硫雜啉(oxathiine)-6-基、呋吡基、噻吡基或三吡基。

Het更佳為吡咯基、吡唑基、噻唑基、呋唑基、吡啶基或2,3-二氫-[1,4]氧硫雜啉-基。

Het更佳為吡咯基、吡唑基、噻唑基或吡啶基。

Het最佳為吡咯基或吡唑基。

較佳X為單鍵。

一方面，Y為O、S、 $N(R^{11})$ 、 CH_2 、 CH_2CH_2 、 $CH_2CH_2CH_2$ 、 $C(CH_3)_2$ 、 $CH(CH_3)$ 、 $CH(C_2H_5)$ 、 $C(CH_3)(C_2H_5)$ 、 $CH(OCH_3)$ 或 $C(OCH_3)_2$ ；更佳為 $N(R^{11})$ 、O、S、 CH_2 、 CH_2CH_2 、 $CH_2CH_2CH_2$ 、 $C(CH_3)_2$ 、 $CH(CH_3)$ 或 $CH(C_2H_5)$ ；又更佳為 $N(R^{11})$ 、O、S、 CH_2 或 CH_2CH_2 ；以及又更佳為O、 CH_2 或 $N(R^{11})$ 。

較佳Y為O、 $N(R^{11})$ 或 $(CR^{12}R^{13})(CR^{14}R^{15})_m(CR^{16}R^{17})_n$ 。

更佳Y為O或 $(CR^{12}R^{13})(CR^{14}R^{15})_m(CR^{16}R^{17})_n$ 。

又更佳Y為 $(CR^{12}R^{13})(CR^{14}R^{15})_m(CR^{16}R^{17})_n$ 。

又更佳Y為 $(CR^{12}R^{13})$ 。

較佳n為0。

較佳 m 為 0。

較佳 R^1 為 氫、 $CH_2C \equiv CR^{18}$ 、 $CH=C=CH_2$ 或 COR^{21} 。

更佳 R^1 為 氫、 $CH_2C \equiv CH$ 、 $CH=C=CH_2$ 、 $C(O)H$ 或 $C(O)CH_3$ 。

又更佳 R^1 為 氫、 $CH_2C \equiv CH$ 、 $CH=C=CH_2$ 或 $C(O)CH_3$ 。

又更佳 R^1 為 氫、 $CH_2C \equiv CH$ 或 $CH=C=CH_2$ 。

最佳 R^1 為 氫。

較佳 R^2 為 氫、鹵素或 C_{1-4} 烷基。

更佳 R^2 為 氫或鹵素。

最佳 R^2 為 氫。

較佳 R^3 為 氫或甲基。

更佳 R^3 為 氫。

較佳 R^4 為 氫、 C_{1-4} 烷基、鹵素、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 $C(O)CH_3$ 或 $C(O)OCH_3$ 。

更佳 R^4 為 氫、 C_{1-2} 烷基、鹵素、 CF_3 、甲氧基、 $C(O)CH_3$ 或 $C(O)OCH_3$ 。

又更佳 R^4 為 氫、甲基、氯、 CF_3 或甲氧基。

最佳 R^4 為 氫或甲基。

較佳 R^5 為 氫、 C_{1-4} 烷基、鹵素、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 $C(O)CH_3$ 或 $C(O)OCH_3$ 。

更佳 R^5 為 氫、 C_{1-2} 烷基、氯、 CF_3 、甲氧基、 $C(O)CH_3$ 或 $C(O)OCH_3$ 。

最佳 R^5 為 氫或甲基。

較佳 R^6 為 氫、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基或 $C(O)CH_3$ 。

更佳 R^6 為 氫、甲基、甲氧基或 $C(O)CH_3$ 。

最佳 R^6 為氫或甲基。

較佳 R^7 為氫、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基或 $C(O)CH_3$ 。

更佳 R^7 為氫、甲基、甲氧基或 $C(O)CH_3$ 。

最佳 R^7 為氫或甲基。

較佳 R^8 為氫、鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基或甲氧基亞甲基。

更佳 R^8 為氫、氯、氟、溴、 C_{1-2} 烷基、 CF_3 、 CF_2Cl 、 CHF_2 、 CH_2F 或甲氧基亞甲基。

又更佳 R^8 為氫、氯、氟、 C_{1-2} 烷基、 CF_3 、 CF_2Cl 、 CHF_2 、 CH_2F 或甲氧基亞甲基。

最佳 R^8 為氫、氯、氟、甲基、 CF_3 、 CHF_2 或 CH_2F 。

較佳 R^9 為氫、鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 鹵烷基或甲氧基亞甲基。

更佳 R^9 為氫、氯、氟、溴、 C_{1-2} 烷基、 CF_3 、 CF_2Cl 、 CHF_2 、 CH_2F 或甲氧基亞甲基。

又更佳 R^9 為氫、氯、氟、 C_{1-2} 烷基、 CF_3 、 CF_2Cl 、 CHF_2 、 CH_2F 或甲氧基亞甲基。

最佳 R^9 為氫、氯、氟、甲基、 CF_3 、 CHF_2 或 CH_2F 。

較佳 R^{10} 為氫、鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基或甲氧基亞甲基。

更佳 R^{10} 為氫、氯、氟、溴、 C_{1-2} 烷基、 CF_3 、 CF_2Cl 、 CHF_2 、 CH_2F 或甲氧基亞甲基。

又更佳 R^{10} 為氫、氯、氟、 C_{1-2} 烷基、 CF_3 、 CF_2Cl 、 CHF_2 、 CH_2F 或甲氧基亞甲基。

最佳 R^{10} 為氫、氟、氯、甲基、 CF_3 、 CHF_2 或 CH_2F 。

於本發明之一方面， R^{11} 為氫、 C_{1-4} 烷基、苄基、甲醯基、 $C(O)CH_3$ 或 $C(O)OC(CH_3)_3$ ；更佳為氫或 C_{1-2} 烷基。

較佳 R^{11} 為 C_{1-4} 烷基、甲醯基、 $C(O)CH_3$ 或 $C(O)OC_{1-6}$ 烷基（選擇性經以鹵素、CN 或 C_{1-4} 烷氧基取代）；

更佳 R^{11} 為 $C(O)OC_{1-4}$ 烷基。

於本發明之一方面， R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 及 R^{17} 各自分別為氫、 C_{1-2} 烷基或甲氧基。

較佳 R^{12} 及 R^{13} 各自分別為氫、鹵素、 C_{1-5} 烷基、 C_{1-3} 烷氧基、 CH_2OH 、 $CH(O)$ 、 C_{3-6} 環烷基、 $CH_2O-C(=O)CH_3$ 、 CH_2-C_{3-6} 環烷基或苄基；或 R^{12} 及 R^{13} 與其附接之碳原子共同形成 $C=O$ 基團或 3-5 員碳環系環；或 R^{12} 及 R^{13} 共同形成 C_{1-5} 亞烷基或 C_{3-6} 亞環烷基。

更佳 R^{12} 及 R^{13} 分別為 H 、 CH_3 、 C_2H_5 、 $n-C_3H_7$ 、 $i-C_3H_7$ 、 $n-C_4H_9$ 、 $sec-C_4H_9$ 、 $i-C_4H_9$ 、 $CH(C_2H_5)_2$ 、 CH_2 -環丙基或環戊基；或 R^{12} 及 R^{13} 與其附接之碳原子共同形成一個 3-員或 5-員碳環系環。

較佳 R^{14} 為 H 或 CH_3 。

較佳 R^{15} 為 H 或 CH_3 。

較佳 R^{16} 為 H 或 CH_3 。

較佳 R^{17} 為 H 或 CH_3 。

較佳 R^{18} 為氫、氟、氯、溴、甲基或甲氧基。

更佳 R^{18} 為氫、氟或甲基。

最佳 R^{18} 為氫。

較佳 R^{19} 為氫、氯、溴、甲基或甲氧基。

更佳 R^{19} 為氫、氯或甲基。

最佳 R^{19} 為氫。

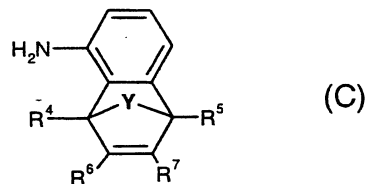
較佳 R^{20} 為氫、氯、溴、甲基或甲氧基。

更佳 R^{20} 為氫、氯或甲基。

最佳 R^{20} 為氫。

較佳 R^{21} 為氫、甲基、 $OC(CH_3)_3$ 或 CH_3OCH_2 。

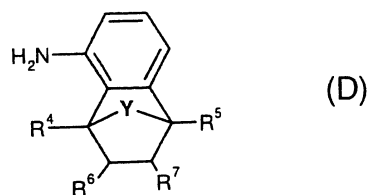
式(C)化合物：



此處 Y 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如前文式(I)化合物，式(C)化合物可用作為製備式(I)化合物之中間物。若干式(C)化合物為新穎，但部分式(C)化合物為已知。

因此於另一方面，本發明提供一種式(C)化合物，此處 Y 為 O 或 S ；以及 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 各自為 $C(O)OCH_3$ ；或 Y 為 $N(R^{11})$ 或 $(CR^{12}R^{13})(CR^{14}R^{15})_m(CR^{16}R^{17})_n$ ； R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、 m 及 n 各自定義如上式(I)化合物； R^{11} 為苄基 (其中苄基選擇性經以至多3個取代基取代，取代基各自分別係選自鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基及 C_{1-4} 烷氧基)；以及 R^{12} 及 R^{13} 與連同其附接之碳原子共同形成一個3-5員碳環系環 (選擇性經以至多3個甲基取代，其含有1或2個各自分別選自 O 及 N 之雜原子)。

式(D)化合物：



此處 Y、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如前文式 (I) 化合物，式 (D) 化合物也可用作為式 (I) 化合物製備之中間物。若干式 (D) 化合物為新穎，但部分為已知。

因此，於另一方面，本發明提供一種式 (D) 化合物，此處 Y 為 O 或 S；以及 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 各自為 $C(O)OCH_3$ ；或 Y 為 $N(R^{11})$ 或 $(CR^{12}R^{13})(CR^{14}R^{15})_m(CR^{16}R^{17})_n$ ； R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、m 及 n 各自定義如上式 (I) 化合物； R^{11} 為苺基 (其中苺基選擇性經以至多 3 個取代基取代，取代基各自分別係選自鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基及 C_{1-4} 烷氧基)；以及 R^{12} 及 R^{13} 與連同其附接之碳原子共同形成一個 3-5 員碳環系環 (選擇性經以至多 3 個甲基取代，其含有 1 或 2 個各自分別選自 O 及 N 之雜原子)。

式 (I)、(C) 及 (D) 化合物係呈不同幾何異構物或光學異構物或不同互變異構形存在。對各個化學式而言，本發明涵蓋全部此等異構物及互變異構物，及其呈全部比例之混合物、以及其同位素形式例如氘化化合物。

下表 1 至 29 顯示本發明化合物。

表 1 提供 94 種式 (C) 化合物，其中 Y、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表 1。

表 1

化合物編號	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Y
1.01	CH ₃	CH ₃	H	H	O
1.02	CH ₃	H	H	H	O
1.03	H	CH ₃	H	H	O
1.04	CH ₃	CH ₃	C(O)CH ₃	H	O
1.05	CH ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₃	O
1.06	CH ₃	C(O)CH ₃	H	H	O
1.07	C(O)CH ₃	CH ₃	H	H	O
1.08	C(O)OCH ₃	H	H	H	O
1.09	H	C(O)OCH ₃	H	H	O
1.10	H	H	H	H	O
1.11	CF ₃	CF ₃	H	H	O
1.12	OCH ₃	OCH ₃	H	H	O
1.13	H	H	CH ₃	CH ₃	O
1.14	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	O
1.15	CH ₃	H	CH ₃	H	O
1.16	H	CH ₃	H	CH ₃	O
1.17	CH ₃	H	CH ₃	H	CH ₂
1.18	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂
1.19	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂
1.20	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃)
1.21	H	H	H	H	CH(CH ₃)
1.22	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂
1.23	H	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂
1.24	H	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂
1.25	H	H	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₂
1.26	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₂
1.27	CH ₃	H	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂
1.28	H	CH ₃	H	CH ₃	C(CH ₃) ₂
1.29	H	H	H	H	C(CH ₃) ₂
1.30	CH ₃	CH ₃	H	H	C(CH ₃) ₂
1.31	H	H	H	H	C(OCH ₃) ₂
1.32	H	H	H	H	S
1.33	CH ₃	CH ₃	H	H	S
1.34	H	H	CH ₃	CH ₃	S
1.35	OCH ₃	OCH ₃	H	H	S
1.36	H	CH ₃	H	H	S
1.37	CH ₃	H	H	H	S
1.38	CH ₃	H	CH ₃	H	S
1.39	H	CH ₃	H	CH ₃	S
1.40	H	OCH ₃	H	H	S
1.41	OCH ₃	H	H	H	S
1.42	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	S
1.43	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	S
1.44	H	H	CH ₃	H	S
1.45	H	H	H	CH ₃	S
1.46	H	H	OCH ₃	H	S
1.47	H	H	H	OCH ₃	S


1.48	H	H	H	H	N(CH ₃)
1.49	CH ₃	CH ₃	H	H	N(CH ₃)
1.50	H	H	H	H	N(C ₂ H ₅)
1.51	H	H	H	H	NCH ₂ Ph
1.52	H	H	H	H	NC(O)CH ₃
1.53	H	H	H	H	NC(O)OC(CH ₃) ₃
1.54	H	H	H	H	NH
1.55	H	H	H	H	NC(O)H
1.56	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)H
1.57	CH ₃	CH ₃	H	H	NH
1.58	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)CH ₃
1.58	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)OC(CH ₃) ₃
1.59	CH ₃	CH ₃	H	H	NCH ₂ Ph
1.60	Cl	Cl	H	H	O
1.61	H	H	H	H	NC(O)OCH ₃
1.62	H	H	H	H	NCH ₂ -4-Cl-Ph
1.63	H	H	H	H	NCH ₂ -4-CH ₃ -Ph
1.64	H	H	H	H	NCH ₂ -3-Cl-Ph
1.65	H	H	H	H	NCH ₂ -3-CF ₃ -Ph
1.66	H	H	H	H	NCH ₂ -3-OCH ₃ -Ph
1.67	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)OCH ₃
1.68	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)OC ₂ H ₅
1.69	H	H	H	H	NC(O)OC ₂ H ₅
1.70	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)OCH ₂ CH ₂ Cl
1.71	H	H	H	H	NC(O)OCH ₂ CH ₂ Cl
1.72	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)OC ₄ H ₉ -(<i>n</i>)
1.73	H	H	H	H	NC(O)OC ₄ H ₉ -(<i>n</i>)
1.74	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)OC ₄ H ₉ -(<i>i</i>)
1.75	H	H	H	H	NC(O)OC ₄ H ₉ -(<i>i</i>)
1.76	H	H	H	H	CH(C ₃ H ₇ -(<i>i</i>)) syn or anti
1.77	H	H	H	H	CH(C ₃ H ₇ -(<i>n</i>)) syn or anti
1.78	H	H	H	H	CH(C ₄ H ₉ -(<i>i</i>)) syn or anti
1.79	H	H	H	H	CH(C ₄ H ₉ -(<i>n</i>)) syn or anti
1.80	H	H	H	H	C(C ₂ H ₄ -(<i>c</i>))
1.81	H	H	H	H	C(C ₄ H ₈ -(<i>c</i>))
1.82	H	H	H	H	CHCH(C ₂ H ₅) ₂ syn or anti
1.83	H	H	H	H	CHCH ₂ (C ₃ H ₅ -(<i>c</i>)) syn or anti
1.84	H	H	H	H	CH(C ₅ H ₉ -(<i>c</i>)) syn or anti
1.85	H	H	H	H	CHCH ₂ OAc syn or anti
1.86	H	H	H	H	CHCHO syn or anti
1.87	H	H	H	H	CHCH ₂ OH syn or anti
1.88	H	H	H	H	CHCH ₂ -C ₆ H ₅ syn or anti
1.89	H	H	H	H	C=O
1.90	H	H	H	H	C(O-C ₃ H ₇ -(<i>n</i>)) ₂
1.91	H	H	H	H	C(O-C ₂ H ₅ -) ₂
1.92	H	H	H	H	CH(C ₂ H ₅) syn or anti
1.93	H	H	H	H	CF ₂
1.94	H	H	H	H	CH(Cl) syn or anti

表2提供111種式(D)化合物，其中Y、R⁴、R⁵、R⁶及R⁷定義如表2。

表2

化合物 編號	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Y
2.01	CH ₃	CH ₃	H	H	O
2.02	CH ₃	H	H	H	O
2.03	H	CH ₃	H	H	O
2.04	CH ₃	CH ₃	C(O)CH ₃	H	O
2.05	CH ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₃	O
2.06	CH ₃	C(O)CH ₃	H	H	O
2.07	C(O)CH ₃	CH ₃	H	H	O
2.08	C(O)OCH ₃	H	H	H	O
2.09	H	C(O)OCH ₃	H	H	O
2.10	H	H	H	H	O
2.11	CF ₃	CF ₃	H	H	O
2.12	OCH ₃	OCH ₃	H	H	O
2.13	H	H	CH ₃	CH ₃	O
2.14	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	O
2.15	CH ₃	H	CH ₃	H	O
2.16	H	H	H	H	CH ₂
2.17	CH ₃	H	CH ₃	H	CH ₂
2.18	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₂
2.19	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₂
2.20	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH(CH ₃) syn or anti
2.21	H	H	H	H	CH(CH ₃) syn or anti
2.22	H	H	H	H	CH(C ₂ H ₅) syn or anti
2.23	H	H	H	H	CH ₂ CH ₂
2.24	CH ₃	CH ₃	H	H	CH ₂ CH ₂
2.25	H	H	CH ₃	CH ₃	CH ₂ CH ₂
2.26	H	H	OCH ₃	H	CH ₂ CH ₂
2.27	H	H	H	OCH ₃	CH ₂ CH ₂
2.28	H	H	H	H	CH ₂ CH ₂ CH ₂
2.29	H	H	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₂
2.30	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃) ₂
2.31	CH ₃	H	CH ₃	H	C(CH ₃) ₂
2.32	H	CH ₃	H	CH ₃	C(CH ₃) ₂
2.33	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	C(CH ₃)(C ₂ H ₅)
2.34	H	H	H	H	C(CH ₃) ₂
2.35	CH ₃	CH ₃	H	H	C(CH ₃) ₂
2.36	H	H	H	H	CH(OCH ₃) syn or anti
2.37	H	H	H	H	S
2.38	CH ₃	CH ₃	H	H	S
2.39	H	H	CH ₃	CH ₃	S
2.40	OCH ₃	OCH ₃	H	H	S
2.41	H	CH ₃	H	H	S
2.42	CH ₃	H	H	H	S
2.43	CH ₃	H	CH ₃	H	S
2.44	H	CH ₃	H	CH ₃	S
2.45	H	OCH ₃	H	H	S
2.46	OCH ₃	H	H	H	S

2.47	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	S
2.48	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	S
2.49	H	H	CH ₃	H	S
2.50	H	H	H	CH ₃	S
2.51	H	H	OCH ₃	H	S
2.52	H	H	H	OCH ₃	S
2.53	H	H	H	H	N(CH ₃)
2.54	CH ₃	CH ₃	H	H	N(CH ₃)
2.55	H	H	H	H	N(C ₂ H ₅)
2.56	H	H	H	H	NCH ₂ Ph
2.57	H	H	H	H	NC(O)CH ₃
2.58	H	H	H	H	NC(O)OC(CH ₃) ₃
2.59	H	H	H	H	NH
2.60	Cl	Cl	H	H	O
2.61	H	H	H	H	NC(O)H
2.62	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)H
2.63	CH ₃	CH ₃	H	H	NH
2.64	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)CH ₃
2.65	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)OC(CH ₃) ₃
2.66	CH ₃	CH ₃	H	H	NCH ₂ Ph
2.67	H	H	H	H	NC(O)OCH ₃
2.68	H	H	H	H	NCH ₂ -4-Cl-Ph
2.69	H	H	H	H	NCH ₂ -4-CH ₃ -Ph
2.70	H	H	H	H	NCH ₂ -3-Cl-Ph
2.71	H	H	H	H	NCH ₂ -3-CF ₃ -Ph
2.72	H	H	H	H	NCH ₂ -3-OCH ₃ -Ph
2.73	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)OCH ₃
2.74	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)OC ₂ H ₅
2.75	H	H	H	H	NC(O)OC ₂ H ₅
2.76	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)OCH ₂ CH ₂ Cl
2.77	H	H	H	H	NC(O)OCH ₂ CH ₂ Cl
2.78	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)OC ₄ H ₉ -(<i>n</i>)
2.79	H	H	H	H	NC(O)OC ₄ H ₉ -(<i>n</i>)
2.80	CH ₃	CH ₃	H	H	NC(O)OC ₄ H ₉ -(<i>i</i>)
2.81	H	H	H	H	NC(O)OC ₄ H ₉ -(<i>i</i>)
2.82	H	H	H	H	CH(C ₃ H ₇ -(<i>i</i>)) syn or anti
2.83	H	H	H	H	CH(C ₃ H ₇ -(<i>n</i>)) syn or anti
2.84	H	H	H	H	CH(C ₄ H ₉ -(<i>i</i>)) syn or anti
2.85	H	H	H	H	CH(C ₄ H ₉ -(<i>n</i>)) syn or anti
2.86	H	H	H	H	C(C ₂ H ₄ -(<i>c</i>))
2.87	H	H	H	H	C(C ₄ H ₈ -(<i>c</i>))
2.88	H	H	H	H	CHCH(C ₂ H ₅) ₂ syn or anti
2.89	H	H	H	H	CHCH ₂ (C ₃ H ₅ -(<i>c</i>)) syn or anti
2.90	H	H	H	H	CH(C ₅ H ₉ -(<i>c</i>)) syn or anti
2.91	H	H	H	H	CHCH ₂ OAc syn or anti
2.92	H	H	H	H	CHCHO syn or anti
2.93	H	H	H	H	CHCH ₂ OH syn or anti
2.94	H	H	H	H	CHCH ₂ -C ₆ H ₅ syn or anti
2.95	H	H	H	H	C=O
2.96	H	H	H	H	C(O-C ₃ H ₇ -(<i>n</i>)) ₂
2.97	H	H	H	H	C(O-C ₂ H ₅) ₂
2.98	H	H	H	H	C(O-C ₃ H ₇ -(<i>i</i>)) ₂
2.99	H	H	H	H	C(O-CH ₃) ₂
2.100	H	H	H	H	C(OH)CH ₃ syn or anti
2.101	H	H	H	H	C(OH)C ₂ H ₅ syn or anti

2.102	H	H	H	H	
2.103	H	H	H	H	CF ₂
2.104	H	H	H	H	CH(F) syn or anti
2.105	H	H	H	H	C(CH ₃) (C ₂ H ₅) syn or anti
2.106	H	H	H	H	C=C(CH ₃) ₂
2.107	H	H	H	H	C=C(C ₂ H ₅) ₂
2.108	H	H	H	H	C=cC ₅ H ₈
2.109	H	H	H	H	C=CH(CH ₃)
2.110	H	H	H	H	C=CH(C ₂ H ₅)
2.111	H	H	H	H	C=cC ₃ H ₄

表Z表示表3[當Z為3]、表4[當Z為4]、表5[當Z為5]、表6[當Z為6]、表7[當Z為7]、表8[當Z為8]、表9[當Z為9]、表10[當Z為10]、表11[當Z為11]、表12[當Z為12]、表13[當Z為13]、表14[當Z為14]、表15[當Z為15]、表16[當Z為16]、表17[當Z為17]、表18[當Z為18]、表19[當Z為19]、表20[當Z為20]、表21[當Z為21]、表22[當Z為22]、表23[當Z為23]、表24[當Z為24]、表25[當Z為25]、表26[當Z為26]、表27[當Z為27]、表28[當Z為28]、以及表示表29[當Z為29]。X為單鍵(-)或雙鍵(=)。

表 Z

化合物 編號	R ¹	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	Y	
Z.001	H	CH ₃	CH ₃	H	H	=	O
Z.002	CH ₂ C≡CH	CH ₃	CH ₃	H	H	=	O
Z.003	CH=C=CH ₂	CH ₃	CH ₃	H	H	=	O
Z.004	C(O)CH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	=	O
Z.005	H	CH ₃	H	H	H	=	O
Z.006	H	H	CH ₃	H	H	=	O
Z.007	H	CH ₃	CH ₃	C(O)CH ₃	H	=	O
Z.008	H	CH ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₃	=	O
Z.009	H	CH ₃	C(O)CH ₃	H	H	=	O
Z.010	H	C(O)CH ₃	CH ₃	H	H	=	O
Z.011	H	COOCH ₃	H	H	H	=	O
Z.012	H	H	COOCH ₃	H	H	=	O
Z.013	H	H	H	H	H	=	O
Z.014	CH ₂ C≡CH	H	H	H	H	=	O
Z.015	CH=C=CH ₂	H	H	H	H	=	O
Z.016	COCH ₃	H	H	H	H	=	O
Z.017	H	CF ₃	CF ₃	H	H	=	O
Z.018	H	OCH ₃	OCH ₃	H	H	=	O
Z.019	H	H	H	CH ₃	CH ₃	=	O
Z.020	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	=	O
Z.021	H	CH ₃	H	CH ₃	H	=	O
Z.022	H	H	CH ₃	H	CH ₃	=	O
Z.023	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	O
Z.024	CH ₂ C≡CH	CH ₃	CH ₃	H	H	-	O
Z.025	CH=C=CH ₂	CH ₃	CH ₃	H	H	-	O
Z.026	COCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	-	O
Z.027	H	CH ₃	H	H	H	-	O
Z.028	H	H	CH ₃	H	H	-	O
Z.029	H	CH ₃	CH ₃	C(O)CH ₃	H	-	O
Z.030	H	CH ₃	CH ₃	H	C(O)CH ₃	-	O
Z.031	H	CH ₃	C(O)CH ₃	H	H	-	O
Z.032	H	C(O)CH ₃	CH ₃	H	H	-	O
Z.033	H	COOCH ₃	H	H	H	-	O
Z.034	H	H	COOCH ₃	H	H	-	O
Z.035	H	H	H	H	H	-	O
Z.036	CH ₂ C≡CH	H	H	H	H	-	O
Z.037	CH=C=CH ₂	H	H	H	H	-	O
Z.038	COCH ₃	H	H	H	H	-	O
Z.039	H	H	H	H	H	-	O
Z.040	H	CF ₃	CF ₃	H	H	-	O
Z.041	H	OCH ₃	OCH ₃	H	H	-	O
Z.042	H	H	H	CH ₃	CH ₃	-	O
Z.043	CH ₂ C≡CH	H	H	CH ₃	CH ₃	-	O
Z.044	CH=C=CH ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	-	O
Z.045	COCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	-	O

Z.046	H	C ₂ H ₅	C ₂ H ₅	H	H	-	O
Z.047	H	CH ₃	H	CH ₃	H	-	O
Z.048	H	H	H	H	H	-	CH ₂
Z.049	CH ₂ C≡CH	H	H	H	H	-	CH ₂
Z.050	CH=C=CH ₂	H	H	H	H	-	CH ₂
Z.051	COCH ₃	H	H	H	H	-	CH ₂
Z.052	H	H	H	H	H	=	CH ₂
Z.053	CH ₂ C≡CH	H	H	H	H	=	CH ₂
Z.054	CH=C=CH ₂	H	H	H	H	=	CH ₂
Z.055	COCH ₃	H	H	H	H	=	CH ₂
Z.056	H	CH ₃	H	CH ₃	H	-	CH ₂
Z.057	H	CH ₃	H	CH ₃	H	=	CH ₂
Z.058	H	H	CH ₃	H	CH ₃	-	CH ₂
Z.059	H	H	CH ₃	H	CH ₃	=	CH ₂
Z.060	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	=	CH ₂
Z.061	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-	CH ₂
Z.062	CH ₂ C≡CH	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-	CH ₂
Z.063	CH=C=CH ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-	CH ₂
Z.064	COCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-	CH ₂
Z.065	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	=	CH(CH ₃) syn or anti
Z.066	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-	CH(CH ₃) syn or anti
Z.067	CH ₂ C≡CH	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-	CH(CH ₃) syn or anti
Z.068	CH=C=CH ₂	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-	CH(CH ₃) syn or anti
Z.069	COCH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-	CH(CH ₃) syn or anti
Z.070	H	H	H	H	H	=	CH(CH ₃) syn or anti
Z.071	H	H	H	H	H	-	CH(CH ₃) syn or anti
Z.072	CH ₂ C≡CH	H	H	H	H	-	CH(CH ₃) syn or anti
Z.073	CH=C=CH ₂	H	H	H	H	-	CH(CH ₃) syn or anti
Z.074	COCH ₃	H	H	H	H	-	CH(CH ₃) syn or anti
Z.075	H	H	H	H	H	-	CH(C ₂ H ₅) syn or anti
Z.076	H	H	H	H	H	-	CH ₂ CH ₂
Z.077	CH ₂ C≡CH	H	H	H	H	-	CH ₂ CH ₂
Z.078	CH=C=CH ₂	H	H	H	H	-	CH ₂ CH ₂
Z.079	COCH ₃	H	H	H	H	-	CH ₂ CH ₂
Z.080	H	CH ₃	CH ₃	H	H	=	CH ₂ CH ₂
Z.081	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	CH ₂ CH ₂
Z.082	H	H	H	CH ₃	CH ₃	=	CH ₂ CH ₂
Z.083	H	H	H	CH ₃	CH ₃	-	CH ₂ CH ₂
Z.084	H	H	H	OCH ₃	H	-	CH ₂ CH ₂
Z.085	H	H	H	H	OCH ₃	-	CH ₂ CH ₂
Z.086	H	H	H	H	H	-	CH ₂ CH ₂ CH ₂
Z.087	H	H	H	H	H	=	CH ₂ CH ₂ CH ₂
Z.088	H	H	H	CH ₃	CH ₃	=	C(CH ₃) ₂
Z.089	H	H	H	CH ₃	CH ₃	-	C(CH ₃) ₂
Z.090	CH ₂ C≡CH	H	H	CH ₃	CH ₃	-	C(CH ₃) ₂
Z.091	CH=C=CH ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	-	C(CH ₃) ₂
Z.092	COCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	-	C(CH ₃) ₂
Z.093	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	=	C(CH ₃) ₂
Z.094	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-	C(CH ₃) ₂
Z.095	H	CH ₃	H	CH ₃	H	-	C(CH ₃) ₂
Z.096	H	H	CH ₃	H	CH ₃	-	C(CH ₃) ₂
Z.097	H	CH ₃	H	CH ₃	H	=	C(CH ₃) ₂
Z.098	H	H	CH ₃	H	CH ₃	=	C(CH ₃) ₂
Z.099	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-	C(CH ₃)(C ₂ H ₅)

Z.100	H	H	H	H	H	-	C(CH ₃) ₂
Z.101	CH ₂ C≡CH	H	H	H	H	-	C(CH ₃) ₂
Z.102	H	H	H	H	H	=	C(CH ₃) ₂
Z.103	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	C(CH ₃) ₂
Z.104	H	CH ₃	CH ₃	H	H	=	C(CH ₃) ₂
Z.105	H	H	H	H	H	=	C(OCH ₃) ₂
Z.106	H	H	H	H	H	-	CH(OCH ₃) ₂ syn or anti
Z.107	H	H	H	H	H	=	S
Z.108	CH ₂ C≡CH	H	H	H	H	=	S
Z.109	CH=C=CH ₂	H	H	H	H	=	S
Z.110	COCH ₃	H	H	H	H	=	S
Z.111	H	H	H	H	H	-	S
Z.112	CH ₂ C≡CH	H	H	H	H	-	S
Z.113	CH=C=CH ₂	H	H	H	H	-	S
Z.114	COCH ₃	H	H	H	H	-	S
Z.115	H	CH ₃	CH ₃	H	H	=	S
Z.116	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	S
Z.117	CH ₂ C≡CH	CH ₃	CH ₃	H	H	-	S
Z.118	CH=C=CH ₂	CH ₃	CH ₃	H	H	-	S
Z.119	COCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	-	S
Z.120	H	H	H	CH ₃	CH ₃	=	S
Z.121	H	H	H	CH ₃	CH ₃	-	S
Z.122	CH ₂ C≡CH	H	H	CH ₃	CH ₃	-	S
Z.123	CH=C=CH ₂	H	H	CH ₃	CH ₃	-	S
Z.124	COCH ₃	H	H	CH ₃	CH ₃	-	S
Z.125	H	OCH ₃	OCH ₃	H	H	=	S
Z.126	H	OCH ₃	OCH ₃	H	H	-	S
Z.127	H	H	CH ₃	H	H	=	S
Z.128	H	H	CH ₃	H	H	-	S
Z.129	H	CH ₃	H	H	H	=	S
Z.130	H	CH ₃	H	H	H	-	S
Z.131	H	CH ₃	H	CH ₃	H	=	S
Z.132	H	CH ₃	H	CH ₃	H	-	S
Z.133	H	H	CH ₃	H	CH ₃	=	S
Z.134	H	H	CH ₃	H	CH ₃	-	S
Z.135	H	H	OCH ₃	H	H	=	S
Z.136	H	H	OCH ₃	H	H	-	S
Z.137	H	OCH ₃	H	H	H	=	S
Z.138	H	OCH ₃	H	H	H	-	S
Z.139	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	=	S
Z.140	H	CH ₃	H	CH ₃	CH ₃	-	S
Z.141	H	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	=	S
Z.142	H	H	CH ₃	CH ₃	CH ₃	-	S
Z.143	H	H	H	CH ₃	H	=	S
Z.144	H	H	H	CH ₃	H	-	S
Z.145	H	H	H	H	CH ₃	=	S
Z.146	H	H	H	H	CH ₃	-	S
Z.147	H	H	H	OCH ₃	H	=	S
Z.148	H	H	H	OCH ₃	H	-	S
Z.149	H	H	H	H	OCH ₃	=	S
Z.150	H	H	H	H	OCH ₃	-	S
Z.151	H	H	H	H	H	=	N(CH ₃)
Z.152	H	H	H	H	H	-	N(CH ₃)
Z.153	CH ₂ C≡CH	H	H	H	H	-	N(CH ₃)

Z.154	CH=C=CH ₂	H	H	H	H	-	N(CH ₃)
Z.155	COCH ₃	H	H	H	H	-	N(CH ₃)
Z.156	H	CH ₃	CH ₃	H	H	=	N(CH ₃)
Z.157	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	N(CH ₃)
Z.158	CH ₂ C≡CH	CH ₃	CH ₃	H	H	-	N(CH ₃)
Z.159	CH=C=CH ₂	CH ₃	CH ₃	H	H	-	N(CH ₃)
Z.160	COCH ₃	CH ₃	CH ₃	H	H	-	N(CH ₃)
Z.161	H	H	H	H	H	=	N(C ₂ H ₅)
Z.162	H	H	H	H	H	-	N(C ₂ H ₅)
Z.163	H	H	H	H	H	=	NCH ₂ Ph
Z.164	H	H	H	H	H	-	NCH ₂ Ph
Z.165	H	H	H	H	H	=	NC(O)CH ₃
Z.166	H	H	H	H	H	-	NC(O)CH ₃
Z.167	H	H	H	H	H	=	NC(O)OC(CH ₃) ₃
Z.168	H	H	H	H	H	-	NC(O)OC(CH ₃) ₃
Z.169	H	H	H	H	H	=	NH
Z.170	H	H	H	H	H	-	NH
Z.171	H	H	H	H	H	=	NC(O)H
Z.172	H	H	H	H	H	-	NC(O)H
Z.173	H	CH ₃	CH ₃	H	H	=	NCH ₂ Ph
Z.174	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	NCH ₂ Ph
Z.175	H	CH ₃	CH ₃	H	H	=	NC(O)CH ₃
Z.176	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	NC(O)CH ₃
Z.177	H	CH ₃	CH ₃	H	H	=	NC(O)OC(CH ₃) ₃
Z.178	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	NC(O)OC(CH ₃) ₃
Z.179	H	CH ₃	CH ₃	H	H	=	NH
Z.180	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	NH
Z.181	H	CH ₃	CH ₃	H	H	=	NC(O)H
Z.182	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	NC(O)H
Z.183	H	H	H	H	H	-	NC(O)OCH ₃
Z.184	H	H	H	H	H	-	NCH ₂ -4-Cl-Ph
Z.185	H	H	H	H	H	-	NCH ₂ -4-CH ₃ -Ph
Z.186	H	H	H	H	H	-	NCH ₂ -3-Cl-Ph
Z.187	H	H	H	H	H	-	NCH ₂ -3-CF ₃ -Ph
Z.188	H	H	H	H	H	-	NCH ₂ -3-OCH ₃ -Ph
Z.189	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	NC(O)OCH ₃
Z.190	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	NC(O)OC ₂ H ₅
Z.191	H	H	H	H	H	-	NC(O)OC ₂ H ₅
Z.192	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	NC(O)OCH ₂ CH ₂ Cl
Z.193	H	H	H	H	H	-	NC(O)OCH ₂ CH ₂ Cl
Z.194	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	NC(O)OC ₄ H ₉ -(n)
Z.195	H	H	H	H	H	-	NC(O)OC ₄ H ₉ -(n)
Z.196	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	NC(O)OC ₄ H ₉ -(i)
Z.197	H	H	H	H	H	-	NC(O)OC ₄ H ₉ -(i)
Z.198	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	NC(O)OC ₃ H ₇ -(n)
Z.199	H	H	H	H	H	-	NC(O)OC ₃ H ₇ -(n)
Z.200	H	CH ₃	CH ₃	H	H	-	NC(O)OC ₃ H ₇ -(i)
Z.201	H	H	H	H	H	-	NC(O)OC ₃ H ₇ -(i)
Z.202	H	H	H	H	H	-	CH(C ₇ H ₇ -(i)) syn or anti
Z.203	CH ₂ C≡CH	H	H	H	H	-	CH(C ₃ H ₇ -(i)) syn or anti
Z.204	CH=C=CH ₂	H	H	H	H	-	CH(C ₃ H ₇ -(i)) syn or anti
Z.205	COCH ₃	H	H	H	H	-	CH(C ₃ H ₇ -(i)) syn or anti
Z.206	H	H	H	H	H	=	CH(C ₃ H ₇ -(i)) syn or anti
Z.207	H	H	H	H	H	-	CH(C ₃ H ₇ -(n)) syn or anti


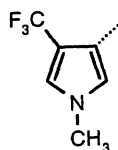
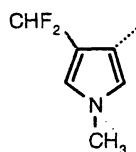
Z.208	H	H	H	H	H	-	CH(C ₄ H ₉ - <i>i</i>) syn or anti
Z.209	H	H	H	H	H	-	CH(C ₄ H ₉ - <i>n</i>) syn or anti
Z.210	H	H	H	H	H	-	C(C ₂ H ₄ - <i>c</i>)
Z.211	H	H	H	H	H	-	C(C ₄ H ₈ - <i>c</i>)
Z.212	H	H	H	H	H	-	CHCH(C ₂ H ₅) ₂ syn or anti
Z.213	H	H	H	H	H	-	CHCH ₂ (C ₃ H ₅ - <i>c</i>) syn or anti
Z.214	H	H	H	H	H	-	CH(C ₃ H ₉ - <i>c</i>) syn or anti
Z.215	H	H	H	H	H	-	CHCH ₂ OAc syn or anti
Z.216	H	H	H	H	H	-	CHCHO syn or anti
Z.217	H	H	H	H	H	-	CHCH ₂ OH syn or anti
Z.218	H	H	H	H	H	-	CHCH ₂ -C ₆ H ₅ syn or anti
Z.219	H	H	H	H	H	-	C=O
Z.220	H	H	H	H	H	-	C(O-C ₃ H ₇ - <i>n</i>) ₂
Z.221	H	H	H	H	H	-	C(O-C ₂ H ₅) ₂
Z.222	H	H	H	H	H	-	C(OH)CH ₃ syn or anti
Z.223	H	H	H	H	H	-	C(OH)C ₂ H ₅ syn or anti
Z.224	H	H	H	H	H	-	
Z.225	H	H	H	H	H	-	CHCH(Ph) ₂ syn or anti
Z.226	H	H	H	H	H	-	CF ₂
Z.227	H	H	H	H	H	-	CH(F) syn or anti
Z.228	H	H	H	H	H	-	C(C ₂ H ₅)(CH ₃) syn or anti
Z.229	H	H	H	H	H	-	CH(<i>sec</i> -C ₄ H ₉) syn or anti
Z.230	H	H	H	H	H	-	C=C(CH ₃) ₂
Z.231	H	H	H	H	H	-	C=C(C ₂ H ₅) ₂
Z.232	H	H	H	H	H	-	C=cC ₅ H ₈
Z.233	H	H	H	H	H	-	C=CH(CH ₃)
Z.234	H	H	H	H	H	-	C=CH(C ₂ H ₅)
Z.235	H	H	H	H	H	-	C=cC ₃ H ₄

表 3 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



R² 及 R³ 皆為氫；以及 X、Y、R¹、R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 定義如表 3。

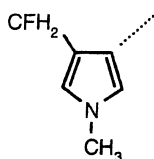
表 4 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



R² 及 R³ 皆為氫；以及 X、Y、R¹、R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 定義如表

4。

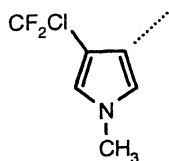
表 5 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表

5。

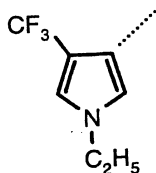
表 6 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表

6。

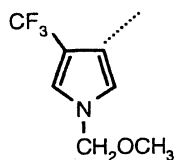
表 7 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表

7。

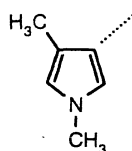
表 8 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表

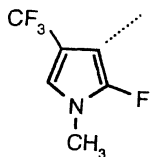
8。

表 9 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



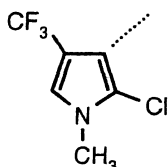
R^2 及 R^3 皆為氫；以及X、Y、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表9。

表10提供235種式(I)化合物，此處Het為



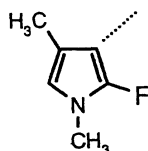
R^2 及 R^3 皆為氫；以及X、Y、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表10。

表11提供235種式(I)化合物，此處Het為



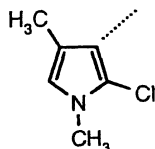
R^2 及 R^3 皆為氫；以及X、Y、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表11。

表12提供235種式(I)化合物，此處Het為



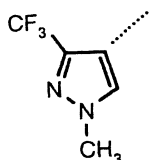
R^2 及 R^3 皆為氫；以及X、Y、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表12。

表13提供235種式(I)化合物，此處Het為



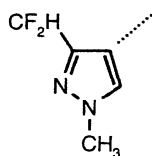
R^2 及 R^3 皆為氫；以及X、Y、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表13。

表14提供235種式(I)化合物，此處Het為



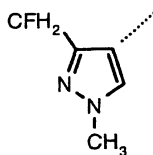
R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表 14。

表 15 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



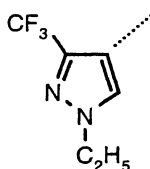
R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表 15。

表 16 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



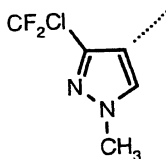
R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表 16。

表 17 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



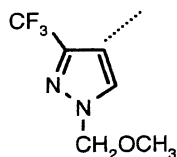
R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表 17。

表 18 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



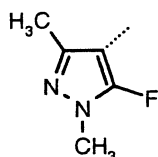
R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表 18。

表 19 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



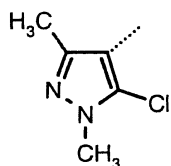
R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表 19。

表 20 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



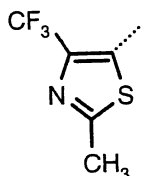
R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表 20。

表 21 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



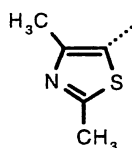
R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表 21。

表 22 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表 22。

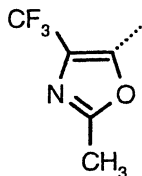
表 23 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表

23。

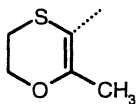
表 24 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表

24。

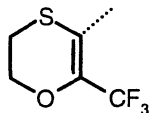
表 25 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表

25。

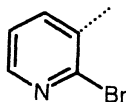
表 26 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表

26。

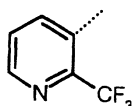
表 27 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



R^2 及 R^3 皆為氫；以及 X 、 Y 、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表

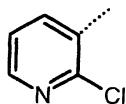
27。

表 28 提供 235 種式 (I) 化合物，此處 Het 為



R^2 及 R^3 皆為氫；以及X、Y、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表28。

表29提供235種式(I)化合物，此處Het為



R^2 及 R^3 皆為氫；以及X、Y、 R^1 、 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 定義如表29。

全文說明中，溫度係以攝氏度數表示；「NMR」表示核磁共振光譜；MS表示質譜；以及「%」為重量百分比，除非對應之濃度係以其它單位表示；「syn」表示相關取代基相對於稠合苯環為syn組態；以及「anti」表示相關取代基相對於稠合苯環為anti組態。

全文說明書使用下列縮寫：

m.p.	= 熔點	b.p.	= 沸點
s	= 單峰	br	= 寬
d	= 雙峰	dd	= 雙重雙峰
t	= 三峰	q	= 四峰
m	= 多峰	ppm	= 每百萬份之份數

表30顯示表1至29化合物之選定之熔點及選定之NMR資料，全部皆以 $CDCl_3$ 作為溶劑(除非另行陳示；若存在有溶劑混合物，則表示為例如 $[CDCl_3/d_6-DMSO]$)(各例中並未嘗試列舉全部特徵資料)。

表30

化合物編號	m.p ($^{\circ}C$)	NMR質子位移 (/ppm) ($CDCl_3$ ，除非另行陳述)
1.01	92-96	6.85 及 6.7(two m, 2 x 2H), 6.47(t, 1H), 約5-3(br., 可與 D_2O 交換, 2H), 2.07(s, 3H), 1.85(s, 3H).
1.10	121-124	

2.01	92-93	7.05(t,1H), 6.7(t,2H), 約 5(brd, 可與 D ₂ O 交換, 2H), 2.0(s,3H), 1.9(m,2H), 1.8(s,3H), 1.7(m,1H), 1.5(m,1H).
2.02	92-93	
2.03	112-114	
2.10	75-76	
2.16	63-64	6.90(dd (~t), $J_1=7.3$ Hz, $J_2=8.2$ Hz, 1H), 6.65(d, $J=7.3$ Hz,1H), 6.46(d, $J=8.2$ Hz,1H), 3.46 (br., 可與 D ₂ O 交換, 2H), 3.35(br.s,1H), 3.31(br.s,1H), 1.87(m,2H), 1.70(m,1H), 1.50(m,1H), 1.18(m,1H).
2.23	74-75	6.99 (t, 1H), 6.63(d 重疊以 t, 2H), 4.0-3.5(br, 可與 D ₂ O 交換, 2H), 3.08(br. s, 1H), 2.94(br.s, 1H), 1.76(m, 4H), 1.40(m, 4H).
2.53	139-140	6.97(t, 1H), 6.69(d, 1H), 6.51(d, 1H), 4.12(br s, 1H), 4.03(br s, 1H), 3.9-3.1(br, 可與 D ₂ O 交換, 2H), 2.06(s, 3H) 重疊以 m at 2.12-2.05(2H), 1.26-1.19 (m, 2H).
2.55	黏性	6.95(t, 1H), 6.68(d, 1H), 6.51(d, 1H), 4.26(d, 1H), 4.18(d, 1H), 3.56(br, 可與 D ₂ O 交換, 2H), 2.22(br d, 2H), 2.10(br, 2H), 1.22(m, 2+2H), 1.03(t,3H).
2.58	89-90	6.94(dd (~t), $J_1=7.3$ Hz, $J_2=7.9$ Hz,1H), 6.68(d, $J=7.3$ Hz,1H), 6.49 (d, $J=7.9$ Hz,1H), 5.11(br,1H), 5.04(br,1H), 3.5-3.0(br,2H, 可與 D ₂ O 交換), 2.07(m,2H), 1.40(s,9H), 1.30(m,2H).
2.59	油	6.91(dd (~t), $J_1=7.3$ Hz, $J_2=7.9$ Hz,1H), 6.66(d, $J=7.3$ Hz,1H), 6.44(d, $J=7.9$ Hz,1H), 4.55(d, $J=\sim 1$ Hz,1H), 4.48(d, $J=\sim 1$ Hz,1H), 4.0-3.0(br, 可與 D ₂ O 交換, H), 2.02(m,2H), 1.25(m,2H).
2.61	176-177	syn-anti-混合物: 8.00 & 7.98(s, 1H), 6.96(t, 1H), 6.71 & 6.67(d, 1H), 6.50(d, 1H), 5.55 & 5.48(br s, 1H), 5.09 & 5.02(br s, 1H), 4.0-3.0(br, 可與 D ₂ O 交換), 2H), 2.06(m, 2H), 1.37-1.47(m, 2H).
2.64	110-111	6.96(t, 1H), 6.58(d, 1H), 6.47(d, 1H), 3.79(br, 2H), 2.29(s, 3H), 2.01(s, 6H), 1.98(m, 2H), 1.54(m, 1H), 1.32(m, 1H).
2.65	94-95	6.96(t, 1H), 6.59(d, 1H), 6.47(d, 1H), ca 3.7(br, 可與 D ₂ O 交換, 2H), 2.18(s, 3H), 1.95(m, 2H), 1.93(s, 3H), 1.49(m, 1H), 1.37(s, 9H), 1.25(m, 1H).
2.67	104-105	6.96(t, 1H), 6.69(d, 1H), 6.50(d, 1H), 5.20(br, 1H), 5.13(br, 1H), 3.64(s, 3H), 2.10(m, 2H), 1.33(m, 2H).
2.73	114-115	6.97(t, 1H), 6.60(d, 1H), 3.80(br, 2H), 3.55(s, 3H), 2.20(s, 3H), 1.97(m, 2H), 1.95(s, 3H), 1.50(m, 1H), 1.29(m, 1H).

2.75	黏性	6.95(t, 1H), 6.70(d, 1H), 6.50(d, 1H), 5.20(br, 1H), 5.13(br, 1H), 4.07(q, 2H), 3.33(br, 2H), 2.10(m, 2H), 1.32(m, 2H), 1.22(t, 3H).
2.77	黏性	6.97(t, 1H), 6.72(d, 1H), 6.53(d, 1H), 5.24(m, 1H), 5.16(m, 1H), 4.27(br, 2H), 3.64(t, 2H), 3.18(br, 2H), 2.12(m, 2H), 1.35(m, 2H).
2.79	黏性	6.96(t, 1H), 6.71(d, 1H), 6.52(d, 1H), 5.20(br, 1H), 5.12(br, 1H), 4.02(t, 2H), 3.19(br, 2H), 2.09(m, 2H), 1.57(m, 2H), 1.34(m, 4H), 0.91(t, 3H).
2.81	黏性	6.96(t, 1H), 6.71(d, 1H), 6.52(d, 1H), 5.21(br, 1H), 5.13(br, 1H), 3.80(d, 2H), 3.25(br, 2H), 2.10(m, 2H), 1.88(m, 1H), 1.33(m, 2H), 0.89(d, 6H).
2.82 syn:anti = 86:14	蠟狀固體	syn 成分資料: 6.91(t, 1H), 6.65(d, 1H), 6.49(d, 1H), 3.5(br, 2H), 3.20(br, 1H), 3.15(br, 1H), 1.92(m, 2H), 1.54(d, 1H), 1.19(m, 2H), 1.03(m, 1H), 0.81(d, 6H).
2.82 syn:anti = 35:65	油	syn-anti 混合物資料: 6.94-6.87(m, 1H), 6.65(m, 1H), 6.52 及 6.46(d, 1H), 3.52(br, 2H), 3.21, 3.16 及 3.14(三, m, 2H), 1.96-1.84(m, 2H), 1.55 及 1.49(二, d, 1H), 1.43 及 1.03(m, 1H), 1.22-1.12(m, 2H), 0.92 及 0.82(二, m, 6H).
2.84 syn:anti = 12:88	黏性	anti 成分資料: 6.89(t, 1H), 6.64(d, 1H), 6.48(d, 1H), ca 4.0-3.75(br, 2H), 3.03(br, 1H), 3.00(br, 1H), 1.96-1.87(m, 3H), 1.58(m, 1H), 1.12(m, 3H), 0.91(d, 6H).
2.84 syn:anti = 82:18	黏性	syn 成分資料: 6.92(t, 1H), 6.64(d, 1H), 6.50(t, 1H), 3.53(br, 2H), 3.08(m, 1H), 3.03(m, 1H), 2.02(t, 1H), 1.90(m, 2H), 1.46(m, 1H), 1.16(m, 2H), 0.92(m, 2H), 0.81(d, 6H).
2.86	黏性	6.92(t, 1H), 6.66(d, 1H), 6.49(d, 1H), 3.52(br, 2H), 2.62(m, 1H), 2.59(m, 1H), 2.07(m, 2H), 1.27(m, 2H), 0.54(m, 2H), 0.45(m, 2H).
2.88 syn:anti = 46:54	黏性	syn-anti-(1:1) 混合物資料: 6.91 及 6.89(二, t, 1H), 6.63(d, 1H), 6.48 及 6.46(二, d, 1H), 3.52(br, 2H), 3.20, 3.16 及 3.13(三, m, 2H), 1.93-1.86(m, 2H), 1.78 及 1.72(二, d, 1H), 1.45(m, 1H), 1.37-1.11(m, 6H), 0.85 及 0.76(二, m, 6H).
2.89 syn:anti = 84:16	黏性	syn 成分資料: 6.90(t, 1H), 6.64(d, 1H), 6.48(d, 1H), 3.51(br, 2H), 3.19(br s, 1H), 3.13(br s, 1H), 2.08(t, 1H), 1.94(m, 2H), 1.20(m, 2H), 0.97(m, 1H), 0.90(m, 1H), 0.57(1H), 0.35(m, 2H), 0.13(m, 2H).

2.90 syn:anti = 74:26	黏性	syn 成分資料： 6.91(t, 1H), 6.64(d, 1H), 6.49(d, 1H), 3.52(br, 2H), 3.12(br s, 1H), 3.08(br s, 1H), 1.91(m, 2H), 1.8-1.0(m, 12H).
2.94 syn:anti = 74:26	黏性	syn 成分資料： 7.28(m, 2H), 7.17(m, 1H), 7.04(d, 2H), 6.99(t, 1H), 6.72(d, 1H), 6.57(d, 1H), 3.6(br, 2H), 3.06(m, 2H), 2.35(m, 2H), 2.20(m,1H), 1.89(m, 2H), 1.20(m, 2H).
2.106	81-82	6.90(t, 1H), 6.67(d, 1H), 6.47(d, 1H), 3.77(m, 1H), 3.73(m, 1H), 3.56(br, 2H), 1.88(m, 2H), 1.63(s,6H), 1.26(m, 2H).
2.107	黏性	6.89(t, 1H), 6.65(d, 1H), 6.46(d, 1H), 3.76(m, 1H), 3.72(m, 1H), 3.56(br, 2H), 2.12-1.90(m, 4H), 1.88(m, 2H), 1.26(m, 2H), 0.94(m, 6H).
3.001	150-154	
3.002	163-165	
3.023	129-133 [呈 旋轉異構物混 合物]	7.62(br), 7.44(d, $J \sim 1$ Hz), 7.32(d, $J \sim 1$ Hz), 7.2(m), 7.0(m); 此等信號來自 6 個質子。額外信 號位於：3.7(s,3H), 1.84(s,3H), 1.82(s,3H), 2.0- 1.5(m,4H).
3.024	172-176	7.5-7.0(m) 及 6.8(br.s) 來自 5H, 5.7-4.8 (二組 AB 系統, 2H), 4.1(m,1H), 3.35 及 3.3(二 s, 來自 3H), 1.85, 1.75, 1.70(三 s, 來自 6H), 2.0-1.4(m,4H).
3.027	非晶形固體	7.60 br.s,1H), 7.34(br.s,1H), 7.22-7.07(m,3H), 7.01(br.s,1H), 5.27(d,1H), 3.71(s,3H), 2.19(m,1H), 1.91(m,1H), 1.83(s,3H), 1.71(m,1H), 1.49(m,1H).
3.028	非晶形固體	7.68(br.,1H), 7.53(d,1H), 7.37(br.s,1H), 7.17(t,1H), 7.00(br.s,1H), 6.96(d,1H), 5.39(d,1H), 3.70(s,3H), 2.25(m,1H), 1.83(s,3H), 1.83-1.66(m,2H), 1.48(m,1H).
3.035	非晶形固體	
3.048	非晶形固體	7.85(d,1H), 7.72(br.,1H), 7.48(br.s,1H), 7.60(t,1H), 7.0(br s,1H), 9.95(d,1H), 3.73(s,3H), 3.43(br.s,1H), 3.37(br.s,1H), 1.9(m,2H), 1.75(m,1H), 1.55(m,1H), 1.2(m,2H).
3.052	136-138	
3.076	154-155	
3.152	非晶形固體	7.71(br, 1H), 7.69(d, 1H), 7.39(br s, 1H), 7.18(t, 1H), 7.06(d, 1H), 6.99(br s, 1H), 4.30(br s, 1H), 4.18(br s, 1H), 3.71(s, 3H), 2.20(m, 2H), 2.12(s, 3H), 1.42-1.21(m, 2H)..
3.162	非晶形固體	7.71(d, 1H), 7.68(br, 1H), 7.39(br s, 1H), 7.17(t, 1H), 7.05(d, 1H), 7.01(br s, 1H), 4.40(br s, 1H), 4.28(br s, 1H), 3.72(s, 3H), 2.24(br, 2H), 2.17(br, 2H), 1.37(t, 1H), 1.25(t, 1H), 1.04(t, 3H).

3.168	非晶形固體	7.71 (br,2H), 7.37 (br.s,1H), 7.14(t,1H), 7.05(d,1H), 7.00(br.s,1H), 5.18(br,1H), 5.11(br,1H), 3.71(s,3H), 2.14(m,2H), 1.50(m,1H), 1.38(s,9H), 1.30(m,1H).
3.172	非晶形固體	syn-anti 混合物: 8.00(s, 1H), 7.72(br, 1H), 7.58 & 7.31(d, 1H), 7.38 & 7.36(br s, 1H), 7.16(t, 1H), 7.11 & 7.09(d, 1H), 7.01(br s, 1H), 5.61 & 5.53 (br s, 1H), 5.19 & 5.09(br s, 1H), 3.71(s, 3H), 2.11(m, 2H), 1.75-1.61(m, 1H), 1.50-1.39(m, 1H).
3.176	231-232	7.48(br, 1H), 7.22(t, 1H), 7.09(br, 1H), 7.06(d, 1H), 6.96(br s, 1H), 5.91(br s, 1H), 3.69(s, 3H), 2.87(m, 1H), 2.22(m, 2H), 1.97(s, 3H), ca 1.9(m, 1H), 1.66(s, 3H), 1.49(s, 3H).
3.183	非晶形固體	7.71(br, 1H), 7.3(br d, 1H), 7.38(br s, 1H), 7.16(t, 1H), 7.06(d, 1H), 7.02(br s, 1H), 5.25(m, 1H), 5.18(m, 1H), 3.72(s, 3H), 3.62(s, 3H), 2.16(m, 2H), 1.55(m, 1H), 1.35(m, 1H).
3.189	非晶形	7.65(br, 1H), 7.31(d, 1H), 7.30(br s, 1H), 7.17(t, 1H), 7.02(d, 1H), 7.01(br s, 1H), 3.72(s, 3H), 3.54(s, 3H), 2.08(s, 3H), 1.99(s, 3H), 1.94(m, 2H), 1.76(m, 1H), 1.33(m, 1H).
3.191	非晶形	7.72(br, 1H), 7.64(d, 1H), 7.38(br s, 1H), 7.16(t, 1H), 7.07(d, 1H), 7.02(br s, 1H), 5.26(m, 1H), 5.20(m, 1H), 4.05(q, 1H), 3.72(s, 3H), 2.15(m, 2H), 1.55(m, 1H), 1.35(m, 1H), 1.20(t, 3H).
3.193	非晶形	7.72(br, 1H), 7.60(d, 1H), 7.38(br s, 1H), 7.16(t, 1H), 7.08(d, 1H), 7.02(br s, 1H), 5.29(m, 1H), 5.22(m, 1H), 4.24(m, 2H), 3.73(s, 3H), 3.61(t, 2H), 2.18(m, 2H), 1.59(m, 1H), 1.37(m, 1H).
3.195	非晶形	7.72(br, 1H), 7.65(d, 1H), 7.38(br s, 1H), 7.15(t, 1H), 7.06(d, 1H), 7.01(br s, 1H), 5.26(m, 1H), 5.18(m, 1H), 4.00(t, 2H), 3.72(s, 3H), 2.15(m, 2H), 1.55(m, 3H), 1.34(m, 3H), 0.89(t, 3H).
3.197	非晶形	7.72(br, 1H), 7.66(d, 1H), 7.38(br s, 1H), 7.16(t, 1H), 7.07(d, 1H), 7.01(br s, 1H), 5.27(m, 1H), 5.19(m, 1H), 3.78(dd, 2H), 3.73(s, 3H), 2.16(m, 2H), 1.87(m, 1H), 1.55(m, 1H), 1.35(m, 1H).
3.202 syn:anti = 90:10	121-125	syn 成分資料: 7.91(d, 1H), 7.72(br, 1H), 7.38(br s, 1H), 7.10(t, 1H), 7.00(br s, 1H), 6.97(d, 1H), 3.72(s, 3H), 3.32(m, 1H), 3.22(m, 1H), 1.95(m, 2H), 1.58(d, 1H), 1.20(m, 2H), 0.90(m, 1H), 0.81(m, 6H).
3.202 syn:anti = 34:66	非晶形	syn-anti 混合物資料: 7.91 及 7.85 (= d, 1H), 7.72(br,1H), 7.37(m, 1H), 7.12-7.05(m, 1H), 6.99(m, 1H), 6.98-6.94(m, 1H), 3.71(s, 3H), 3.32, 3.25, 3.22 及 3.19(四 m, 2H), 1.96-1.88(m, 2H), 1.58 及 1.51(= d, 1H), 1.44 及

		0.98(二m, 1H), 1.26-1.12(m, 2H). 0.91 及 0.81(二m, 6H).
3.208 syn:anti = 10:90	130-131	anti 成分資料: 7.85(d, 1H), 7.70(br, 1H), 7.38(br s, 1H), 7.08(t, 1H), 6.99(br s, 1H), 6.95(d, 1H), 3.71(s, 3H), 3.12(m, 1H), 3.06(m, 1H), 2.0-1.9(m, 3H), 1.6-1.5(m, 2H), 1.22-1.11(m, 3H), 0.92(d, 6H).
3.208 syn:anti = 85:15	非晶形	syn 成分資料: 7.92(d, 1H), 7.70(br, 1H), 7.38(br s, 1H), 7.11(t, 1H), 6.99(br s, 1H), 6.96(d, 1H), 3.71(s, 1H), 3.19(m, 1H), 3.10(m, 1H), 2.06(t, 1H), 1.97(m, 2H), 1.44(m, 1H), 1.27-1.11(m, 2H), 0.90(m, 2H), 0.79(d, 6H).
3.210	155-157	7.84(d, 1H), 7.68(br, 1H), 7.37(br s, 1H), 7.11(t, 1H), 6.98(d, 1H), 3.71(s, 3H), 2.69(m, 1H), 2.65(m, 1H), 2.09(m, 2H), 1.33(m, 1H), 1.32(m, 1H), 0.49(m, 4H).
3.212	非晶形	syn-anti 混合物資料: 7.92 及 7.85(二d, 1H), 7.72(br, 1H), 7.38(m, 1H), 7.13-7.06(m, 1H), 7.00(m, 1H), 6.96(m, 1H), 3.72(s, 3H), 3.32, 3.25, 3.22 及 3.19(四m, 2H), 1.92(m, 2H), 1.82 及 1.72(二d, 1H), 1.43(m, 1H), 1.35-1.05(m, 6H), 0.84 及 0.73(二t, 6H).
3.213 syn:anti = 95:05	115-117	syn 成分資料: 7.90(d, 1H), 7.71br, 1H), 7.38(br s, 1H), 7.10(t, 1H), 6.99(br s, 1H), 6.96(d, 1H), 3.71(s, 3H), 3.31(m, 1H), 3.18(m, 1H), 2.12(t, 1H), 1.98(m, 2H), 1.28-1.14(m, 3H), 1.0-0.78(m, 2H), 0.55(m, 1H), 0.34(m, 2H), 0.16(m, 2H).
3.214 syn:anti = 74:26	非晶形	syn 成分資料: 7.93(d, 1H), 7.72(br, 1H), 7.38(br s, 1H), 7.11(t, 1H), 7.00(br s, 1H), 6.95(d, 1H), 3.71(s, 3H), 3.24(m, 1H), 3.14(m, 1H), 1.94(m, 2H), 1.8-0.88(m, 12H).
3.218 syn:anti = 92:08	143-146	syn 成分資料: 7.96(d, 1H), 7.70(br, 1H), 7.37(br s, 1H), 7.30-6.95(m, 8H), 3.72(s, 3H), 3.18(m, 1H), 3.12(m, 1H), 2.37-2.07(m, 3H), 1.93(m, 2H), 1.25(m, 2H).
3.230	非晶形	7.82(d, 1H), 7.75(br, 1H), 7.39(br s, 1H), 7.08(t, 1H), 7.01(br s, 1H), 6.98(d, 1H), 3.83(m, 1H), 3.78(m, 1H), 3.72(s, 3H), 1.90(m, 2H), 1.61(s, 6H), 1.35-1.21(m, 2H).
3.231	非晶形	7.81(d, 1H), 7.75(br, 1H), 7.38(br s, 1H), 7.08(t, 1H), 7.00(br s, 1H), 6.97(d, 1H), 3.85(m, 1H), 3.77(m, 1H), 3.72(s, 3H), 2.1-1.9(m, 6H), 1.38-1.21(m, 2H), 0.93(m, 6H).
4.048	黏性油	7.87(br, 1H), 7.80(d, 1H), 7.27(m, 1H), 7.07(t, 1H), 6.96(d, 1H), 6.95(t, $J=56$ Hz, 1H), 6.87(m, 1H), 3.68(s, 3H), 3.47(br.s, 1H), 3.36(br.s, 1H), 1.90(m, 2H), 1.74(m, 1H), 1.50(m, 1H), 1.16-1.24(m, 2H).
8.048	黏性油	7.83(br d, 1H), 7.76(br, 1H), 7.55(br s, 1H), 7.12(br s,

		1H), 7.09(t, 1H), 6.98(d, 1H), 5.19(s, 2H), 3.45(br s, 1H), 3.37(br s, 1H), 3.32(s, 3H), 1.92(m, 2H), 1.77(m, 1H), 1.52(m, 1H), 1.22(m, 2H).
11.048	黏性油	7.90(br d, 1H), 7.73(br, 1H), 7.09(t, 1H), 7.04(br s, 1H), 6.98(d, 1H), 3.68(s, 3H), 3.43(br s, 1H), 3.38(br s, 1H), 1.90(m, 2H), 1.77(m, 1H), 1.52(m, 1H), 1.24(m, 2H).
14.002	148-151	
14.023	162-166	
14.024	148-150	
14.027	182-184	
14.028	非晶形固體	8.04(s,1H), 7.66(br.,1H), 7.45(d,1H), 7.19(t,1H), 6.99(d,1H), 5.37(d,1H), 3.98(s,3H), 2.25(m,1H), 1.83(s,3H), 1.83-1.65(m,2H), 1.47(m,1H).
14.035	144-146	
14.048	非晶形固體	8.05(s,1H), 7.8(d,1H), 7.7(br.s,1H), 7.6(t,1H), 7.0(d,1H), 3.98(s,3H), 3.43(br.s,1H), 3.39(br.s,1H), 1.9(m,2H), 1.75(m,1H), 1.54(m,1H), 1.2(m,2H).
14.052	121-122	
14.076	127-130	
14.152	非晶形固體	8.09(s, 1H), 7.75(br, 1H), 7.62(d, 1H), 7.19(t, 1H), 7.09(d, 1H), 4.30(br, 1H), 4.20(br s, 1H), 3.98(s, 3H), 2.2-2.1(m, 2H), 2.11(br s, 3H), 1.4-1.2(m, 2H).
14.162	142-147	8.09(s, 1H), 7.74(br, 1H), 7.63(d, 1H), 7.19(t, 1H), 7.08(d, 1H), 4.40(br s, 1H), 4.31(br s, 1H), 4.00(s, 3H), 2.26(br, 2H), 2.15(br, 2H), 1.38(t, 1H), 1.26(t, 1H), 1.05(t, 3H).
14.168	非晶形固體	8.04(s,1H), 7.72(br,1H), 7.60(d,1H), 7.16(t,1H), 7.08(d,1H), 5.15(br,1H), 5.12(br,1H), 3.99(s,3H), 2.13(m,2H), 1.49(m,1H), 1.38(s,9H), 1.32(m,1H).
14.172	123-124	syn-anti 混合物; DMSO: 9.97 (s, 1H), 8.45 & 8.43(br, 1H), 7.87(br s, 1H), 7.21 & 7.12(d, 1H), 7.06(m, 2H), 5.42 & 5.29(br, 1H), 5.24(m, 1H), 3.88(s, 3H), 1.87(m, 2H), 1.45 & 1.39(m, 1H), 1.21(m, 1H).
14.176	232-233	8.12(br, 1H), 7.23(t, 1H), 7.09-7.05(m, 2H), 5.93(s, 1H), 3.97(s, 3H), 2.90(m, 1H), 2.32-2.20(m, 2H), 1.97(s, 3H), 1.90(m, 1H), 1.67(s, 3H), 1.48(s, 3H).
14.178	148-150	7.98(br, 1H), 7.67(br, 1H), 7.30(d, 1H), 7.19(t, 1H), 7.04(d, 1H), 3.99(s, 3H), 2.05(s, 3H), 1.97(s, 3H) 重疊以 m (2.00-1.89, 2H), 1.68(m, 1H), 1.35(s, 9H), 1.31(m, 1H).
14.183	非晶形固體	8.05(s, 1H), 7.74(br, 1H), 7.53(d, 1H), 7.17(t, 1H), 7.10(d, 1H), 5.23(m, 1H), 5.19(m, 1H), 4.00(s, 3H), 3.62(s, 3H), 2.14(m, 2H), 1.55(m, 1H), 1.35(1H).
14.189	非晶形	7.99(br s, 1H), 7.68(br, 1H), 7.28(d, 1H), 7.19(t, 1H), 7.06(d, 1H), 3.99(s, 3H), 3.54(s, 3H), 2.06(s, 3H), 2.02-1.91(m, 2H), 1.72(m, 1H), 1.35(m, 1H).
14.191	非晶形	8.05(s, 1H), 7.75(br, 1H), 7.55(d, 1H), 7.17(t, 1H),

		7.11(d, 1H), 5.23(m, 1H), 5.20(m, 1H), 4.05(q, 2H), 4.00(s, 3H), 2.15(m, 2H), 1.54(m, 1H), 1.35(m, 1H), 1.20(t, 3H).
14.193	非晶形	8.05(s, 1H), 7.72(br, 1H), 7.52(d, 1H), 7.18(t, 1H), 7.12(d, 1H), 5.27(m, 1H), 5.23(m, 1H), 4.24(m, 2H), 4.00(s, 3H), 3.61(t, 2H), 2.19(m, 2H), 1.58(m, 1H), 1.38(m, 1H).
14.195	非晶形	8.05(s, 1H), 7.75(br, 1H), 7.55(d, 1H), 7.17(t, 1H), 7.10(d, 1H), 5.23(m, 1H), 5.20(m, 1H), 4.00(s, 3H), 4.00(t, 2H), 2.15(m, 2H), 1.55(m, 3H), 1.35(m, 3H), 0.89(t, 3H).
14.197	非晶形	8.05(s, 1H), 7.77(br, 1H), 7.55(d, 1H), 5.24(m, 1H), 5.20(m, 1H), 3.99(s, 3H), 3.78(dd, 2H), 2.17(m, 2H), 1.86(m, 1H), 1.55(m, 1H), 1.36(m, 1H), 0.87(d, 6H).
14.202 syn:anti = 90:10	145-150	syn 成分資料： 8.06(s, 1H), 7.84(d, 1H), 7.70(br, 1H), 7.12(t, 1H), 7.01(d, 1H), 3.99(s, 3H), 3.29(m, 1H), 3.23(m, 1H), 1.96(m, 2H), 1.60(d, 1H), 1.20(m, 2H), 0.96(m, 1H), 0.80(m, 6H).
14.202 syn:anti = 28:72	非晶形	syn-anti 混合物資料： 8.05(br, 1H), 7.83 及 7.78(二 d, 1H), 7.70(br, 1H), 7.14-7.07(m, 1H), 7.01-6.98(m, 1H), 3.99(s, 3H), 3.30 及 3.21(二 m, 2H), 1.97-1.90(m, 2H), 1.60 及 1.51(二 d, 1H), 1.43 及 0.98(二 m, 1H), 1.26-1.12(m, 2H), 0.91 及 0.82(二 m, 6H).
14.208 syn:anti = 10:90	132-133	anti 成分資料： 8.04(s, 1H), 7.77(d, 1H), 7.68(br, 1H), 7.09(t, 1H), 6.99(d, 1H), 3.99(s, 3H), 3.08(m, 2H), 2.0-1.91(m, 3H), 1.63-1.55(m, 2H), 1.22-1.10(m, 3H), 0.91(d, 6H).
14.208 syn:anti = 85:15	130-133	syn 成分資料： 8.05(br s, 1H), 7.84(d, 1H), 7.68(br, 1H), 7.12(t, 1H), 7.00(d, 1H), 3.99(s, 3H), 3.16(m, 1H), 3.12(m, 1H), 2.10(t, 1H), 1.97(m, 2H), 1.44(m, 1H), 1.22(m, 2H), 0.91(m, 2H), 0.80(d, 6H).
14.210	151-153	8.04(br, 1H), 7.76(d, 1H), 7.65(br, 1H), 7.12(t, 1H), 7.02(d, 1H), 3.98(s, 3H), 2.66(m, 2H), 2.10(m, 2H), 1.29(m, 2H), 0.49(m, 4H).
14.212 syn:anti = 48:52	非晶形	syn-anti 混合物資料： 8.05(br, 1H), 7.84 及 7.78(二 d, 1H), 7.69(br, 1H), 7.14-7.08(m, 1H), 6.99(m, 1H), 3.99(s, 3H), 3.29, 3.24 及 3.20(三 m, 2H), 1.95(m, 2H), 1.83 及 1.74(二 d, 1H), 1.44(m, 1H), 1.35-1.11(m, 6H), 0.85 及 0.74(二 t, 6H).
14.213 syn:anti = 90:10	非晶形	syn 成分資料： 8.05(s, 1H), 7.83(d, 1H), 7.70(br, 1H), 7.12(t, 1H), 7.00(d, 1H), 3.99(s, 3H), 3.29(m, 1H), 3.20(m, 1H), 2.14(t, 1H), 2.00(m, 2H), 1.16(m, 2H), 1.02-0.78(m,

		2H), 0.55(m, 1H), 0.35(m, 2H), -016(m, 2H).
14.214 syn:anti = 74:26	非晶形	syn 成分資料: 8.05(s, 1H), 7.85(d, 1H), 7.69(br, 1H), 7.12(t, 1H), 7.00(d, 1H), 3.99(s, 3H), 3.21(m, 1H), 3.16(m, 1H), 1.96(m, 2H), 1.80-0.0.9(m, 12H).
14.218 syn:anti = 78:22	非晶形	syn 成分資料: 8.05(s, 1H), 7.89(d, 1H), 7.68(br, 1H), 7.30-6.92(m, 7H), 4.00(s, 3H), 3.14(m, 2H), 2.60-2.10(m, 3H), 1.94(m, 2H), 1.29-1.15(m, 2H).
14.230	183-187	8.06(br s, 1H), 7.74(d, 重疊以 br, 2H), 7.09(t, 1H), 7.02(d, 1H), 4.00(s, 3H), 3.83(m, 1H), 3.80(m, 1H), 1.92(m, 2H), 1.62(s, 6H), 1.35-1.11(m, 2H).
14.231	非晶形	8.05(br s, 1H), 7.73(d, 重疊以 br, 2H), 7.09(t, 1H), 7.01(d, 1H), 3.99(s, 3H), 3.82(m, 1H), 3.79(m, 1H), 2.1-1.95(m, 4H), 1.92(m, 2H), 1.38-1.23(m, 2H), 0.93(m, 6H).
15.013	139-140	
15.023	非晶形固體	7.99(s,1H), 7.93(br.,1H), 7.22-7.16(m,2H), 7.03(d,1H), 6.88(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$,1H), 3.93(s,3H), 1.90(m,2H), 1.82(s,3H), 1.80(s,3H), 1.55(m,2H).
15.027	168-169	
15.028	145-147	
15.035	136-139	
15.048	132-134	8.11(br.,1H), 8.03(s,1H), 7.83(d,1H), 7.08(t,1H), 6.98(d,1H), 6.88(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$,1H), 3.93(s,3H), 3.49(br.s,1H), 3.37(br.s,1H), 1.91(m,2H), 1.74(m,1H), 1.51(m,1H), 1.22(m,2H).
15.049	107-108	
15.050	115-117	
15.052	118-122	
15.076	148-150	
15.086	非晶形固體	8.00(s, 1H), 7.97(br, 1H), 7.64(d, 1H), 7.15(t, 1H), 6.94(d, 1H), 6.86(t, $J_{HF}=54.3\text{Hz}$, 1H), 3.92(s, 3H), 3.25(br. s, 1H), 3.03(br. s, 1H), 1.94(d, 2H), 1.8-1.6(m, 8H).
15.152	141-147(分解)	8.07(br, 1H), 8.05(s, 1H), 7.76(d, 1H), 7.18(t, 1H), 7.06(d, 1H), 6.87(t, $J_{HF}=54.2\text{Hz}$, 1H), 4.26(br s, 1H), 4.12(br s, 1H), 3.95(s, 3H), 2.16(m, 2H), 2.07(s, 3H), 1.37-1.19(m, 2H).
15.162	非晶形固體	8.17(br, 1H), 8.09(s, 1H), 7.72(d, 1H), 7.20(t, 1H), 7.07(d, 1H), 6.90(t, $J_{HF}=54.2\text{Hz}$, 1H), 4.56(br s, 1H), 4.38(br s, 1H), 3.96(s, 3H), 2.32(br, 2H), 2.23(br, 2H), 1.42(t, 1H), 1.30(t, 1H), 1.08(t, 3H).
15.168	黏性	8.12 (br,1H), 8.04(s,1H), 7.72(d,1H), 7.15(t,1H), 7.06 (d,1H), 6.89(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$,1H), 5.22(br,1H), 5.11(br,1H), 3.05(s,3H), 2.12(m,2H), 1.53-1.24(m,2H), 1.37(s,9H).
15.172	非晶形固體	syn-anti 混合物: 8.22 & 8.16(br, 1H), 8.06(br s, 1H),

		8.00(s, 1H), 7.58 & 7.42(d, 1H), 7.17(t, 1H), 7.10(d, 1H), 6.93 & 6.91(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 5.64 & 5.53(br s, 1H), 5.21 & 5.10(br s, 1H), 3.95(s, 3H), 2.10(m, 2H), 1.63(m, 1H), 1.43(m, 1H).
15.176	223-224	
15.183	非晶形固體	8.13(br, 1H), 8.05(s, 1H), 7.65(d, 1H), 7.17(t, 1H), 7.08(d, 1H), 6.91(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 5.29(br s, 1H), 5.19(br s, 1H), 3.96(s, 3H), 3.62(s, 3H), 2.15(m, 2H), 1.53(m, 1H), 1.35(m, 1H).
15.189	非晶形	7.95(br, 2H), 7.25(d, 1H), 7.19(t, 1H), 7.06(d, 1H), 6.94(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 3.94(s, 3H), 3.54(s, 3H), 2.07(s, 3H), 1.99(s, 3H), 1.98(m, 2H), 1.72(m, 1H), 1.35(m, 1H).
15.191	非晶形	8.15(br, 1H), 8.05(s, 1H), 7.66(d, 1H), 7.17(t, 1H), 7.08(d, 1H), (6.91(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 5.30(m, 1H), 5.20(m, 1H), 4.05(q, 2H), 3.95(s, 3H), 2.14(m, 2H), 1.52(m, 1H), 1.35(m, 1H), 1.20(t, 3H).
15.193	非晶形	8.12(br, 1H), 8.05(s, 1H), 7.64(d, 1H), 7.18(t, 1H), 7.09(d, 1H), 6.91(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 5.32(m, 1H), 5.23(m, 1H), 4.24(m, 2H), 3.96(s, 3H), 3.61(t, 2H), 2.18(m, 2H), 1.55(m, 1H), 1.37(m, 1H).
15.195	非晶形	8.13(br, 1H), 8.05(s, 1H), 7.67(d, 1H), 7.16(t, 1H), 7.07(d, 1H), 6.91(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 5.29(M, 1H), 5.18(m, 1H), 4.01(t, 2H), 3.95(s, 3H), 2.16(m, 2H), 1.53(m, 3H), 1.33(m, 3H), 0.88(t, 3H).
15.197	非晶形	8.14(br, 1H), 8.05(s, 1H), 7.69(d, 1H), 7.15(t, 1H), 7.08(d, 1H), 6.91(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 5.30(m, 1H), 5.20(m, 1H), 3.96(s, 3H), 3.79(dd, 2H), 2.16(m, 2H), 1.86(m, 1H), 1.53(m, 1H), 1.35(m, 1H), 0.87(d, 6H).
15.202 syn:anti = 90:10	110-112	syn 成分資料： 8.10(br, 1H), 8.05(br s, 1H), 7.92(d, 1H), 7.11(t, 1H), 6.98(d, 1H), 6.87(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 3.95(s, 3H), 3.37(m, 1H), 3.22(m, 1H), 1.95(m, 2H), 1.58(d, 1H), 1.19(m, 2H), 0.98(m, 1H), 0.81(m, 6H).
15.202 syn:anti = 35:65	非晶形	syn-anti 混合物資料： 8.09(br, 1H), 8.04(br, 1H), 7.91 及 7.84(二 d, 1H), 7.13-7.06(m, 1H), 7.02-6.96(m, 1H), 6.88 及 6.87(二 t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 3.95(s, 3H), 3.38, 3.30, 3.23 及 3.20(四 m, 2H), 1.96-1.89(m, 2H), 1.58 及 1.50(二 d, 1H), 1.44 及 0.97(二 m, 1H), 1.20-1.12(m, 2H), 0.91 及 0.82(二 m, 6H).
15.208 syn:anti = 12:88	黏性	anti 成分資料： 8.07(br, 1H), 8.03(br s, 1H), 7.84(d, 1H), 7.08(t, 1H), 6.97(d, 1H), 6.88(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 3.94(s, 3H), 3.17(m, 1H), 3.07(m, 1H), 1.93(m, 3H), 1.59(m, 1H), 1.28-1.12(m, 4H), 0.91(d, 6H).
15.208	117-119	syn 成分資料：

syn:anti = 93:7		8.08(br, 1H), 8.04(br s, 1H), 7.91(d, 1H), 7.12(t, 1H), 6.98(d, 1H), 6.87(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 3.94(s, 3H), 3.25(m, 1H), 3.11(m, 1H), 2.07(t, 1H), 1.96(m, 2H), 1.45(m, 1H), 1.19(m, 2H), 0.89(m, 2H), 0.80(d, 6H).
15.210	158-160	8.04(br, 2H), 7.84(d, 1H), 7.12(t, 1H), 7.00(d, 1H), 6.86(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 3.94(s, 3H), 2.74(m, 1H), 2.66(m, 1H), 2.11(m, 2H), 1.33(m, 1H), 1.26(m, 1H), 0.48(m, 4H).
15.212 syn:anti = 46:54	非晶形	syn-anti 混合物資料： 8.09(br, 1H), 8.04(br s, 1H), 7.92 及 7.85(二 d, 1H), 7.13-7.07(m, 1H), 6.98(m, 1H), 6.88 及 6.87(二 t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 3.95(s, 3H), 3.37, 3.31, 3.23 及 3.20(四 m, 2H), 1.95(m, 2H), 1.82 及 1.73(二 d, 1H), 1.46(m, 1H), 1.37-1.10(m, 6H), 0.85 及 0.74(二 t, 6H).
15.213 syn:anti = 90:10	131-135	syn 成分資料： 8.08(br, 1H), 8.04(s, 1H), 7.90(d, 1H), 7.11(t, 1H), 6.98(d, 1H), 6.87(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 3.95(s, 3H), 3.37(m, 1H), 3.19(m, 1H), 2.13(t, 1H), 1.98(m, 2H), 1.24(m, 2H), 1.1-0.78(m, 2H), 0.55(m, 1H), 0.35(m, 2H), -0.16(m, 2H).
15.214 syn:anti = 74:26	非晶形	syn 成分資料： 8.09(br, 1H), 8.04(s, 1H), 7.92(d, 1H), 7.12(t, 1H), 6.98(d, 1H), 6.87(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 3.95(s, 3H), 3.29(m, 1H), 3.15(m, 1H), 1.95(m, 2H), 1.80-0.90(m, 12H).
15.218 syn:anti = 74:26	非晶形	syn 成分資料： 8.08(br, 1H), 8.05(s, 1H), 7.96(d, 1H), 7.3-6.9(m, 7H), 6.85(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 3.96(s, 3H), 3.23(m, 1H), 3.13(m, 1H), 2.4-2.07(m, 3H), 1.95(m, 2H), 1.3-1.1(m, 2H).
15.230	非晶形	8.15(br, 1H), 8.05(br s, 1H), 7.83(d, 1H), 7.09(t, 1H), 7.00(d, 1H), 6.90(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 3.94(s, 3H), 3.92(m, 1H), 3.80(m, 1H), 1.91(m, 2H), 1.61(s, 6H), 1.35-1.22(m, 2H).
15.231	非晶形	8.13(br, 1H), 8.04(br s, 1H), 7.82(d, 1H), 7.09(t, 1H), 6.99(d, 1H), 6.90(t, $J_{HF}=54\text{Hz}$, 1H), 3.94(s, 3H), 3.91(m, 1H), 3.78(m, 1H), 2.1-1.95(m, 4H), 1.91(m, 2H), 1.39-1.21(m, 2H), 0.93(m, 6H).
16.048	非晶形固體	8.16(brd d, 1H), 7.98(brd s, 1H), 7.85(d, 1H), 7.10(t, 1H), 6.99(d, 1H), 5.72(AB-信號, 1H), 5.59(AB-信號, 1H), 3.94(s, 3H), 3.47(br s, 1H), 3.38(brd s, 1H), 1.91(m, 2H), 1.76(m, 1H), 1.52(m, 1H), 1.23(m, 2H).
16.076	黏性	8.13(brd, 1H), 7.95(brd s, 1H), 7.70(d, 1H), 7.19(t, 1H), 7.02(d, 1H), 5.64(d, $J_{HF}=48.7\text{Hz}$, 2H), 3.92(s, 3H), 3.15(br s, 1H), 3.02(brd s, 1H), 1.77(d, 4H), 1.39(d, 4H).

21.023	161-165	
20.048	132-133	
21.048	136-138	
22.048	黏性油	7.78(br.,1H), 7.68(d,1H), 7.12-7.03(m,2H), 3.39(br.s,2H), 2.76(s,3H), 1.92(m,2H), 1.76(m,1H), 1.53(m,1H), 1.20(m,2H).
23.048	黏性油	7.60(br d, 1H), 7.38(br, 1H), 7.10(t, 1H), 7.03(d, 1H), 3.39(m, 2H), 2.76(s, 3H), 1.93(m, 2H), 1.78(m, 1H), 1.55(m, 1H), 1.23(m, 2H).
24.048	黏性油	7.85(br.,1H), 7.72(d,1H), 7.12-7.02(m,2H), 3.43(br.s,1H), 3.40(br.s,1H), 2.63(s,3H), 1.93(m,2H), 1.78(m,1H), 1.55(m,1H), 1.23(m,2H).
29.048	158-160	
29.052	151-152	
29.202 syn:anti = 90:10	146-147	syn 成分資料： 8.53(m, 1H), 8.28(d, 1H), 8.17(br, 1H), 7.82(d, 1H), 7.42(d, 1H), 7.15(t, 1H), 7.05(d, 1H), 3.37(m, 1H), 3.26(m, 1H), 1.98(m, 2H), 1.62(d, 1H), 1.24(m, 2H), 0.97(m, 1H), 0.82(d, 6H).
29.202 syn:anti = 34:66	非晶形	syn-anti 混合物資料： 8.53(m, 1H), 8.27(m, 1H), 8.15(br, 1H), 7.82-7.77(m, 1H), 7.42(m, 1H), 7.17-7.10(m, 1H), 7.06-7.02(m, 1H), 3.38, 3.30, 3.26 及 3.23(四 m, 2H), 1.99-1.90(m, 2H), 1.62 及 1.54(二 d, 1H), 1.46 及 0.99(二 m, 1H), 1.30-1.10(m, 2H), 0.91 及 0.83(二 m, 6H).
29.208 syn:anti = 82:18	非晶形	
29.213 syn:anti = 90:10	非晶形	syn 成分資料： 8.52(m, 1H), 8.29(d, 1H), 8.20(br, 1H), 7.81(d, 1H), 7.43(d, 1H), 7.15(t, 1H), 7.04(d, 1H), 3.36(m, 1H), 3.23(m, 1H), 2.16(t, 1H), 2.00(m, 2H), 1.29(m, 3H), 0.98(m, 1H), 0.86(m, 1H), 0.57(m, 1H), 0.35(m, 2H), -0.15(m, 2H).
29.208 syn:anti = 15:85	非晶形	anti 成分資料： 8.52(m, 1H), 8.28(d, 1H), 8.16(br, 1H), 7.78(d, 1H), 7.41(d, 1H), 7.12(t, 1H), 7.02(d, 1H), 3.17(m, 1H), 3.10(m, 1H), 1.96(m, 3H), 1.59(m, 1H), 1.26-1.1(m 4H), 0.91(d, 6H).
29.212 syn:anti = 47:53	非晶形	syn-anti 混合物資料： 8.52(m, 1H), 8.26(m, 1H), 8.15(br, 1H), 7.83 及 7.78(二 d, 1H), 7.42(m, 1H), 7.17-7.10(m, 1H), 7.04(m, 1H), 3.37, 3.30, 3.27 及 3.23(四 m, 2H), 1.95(m, 2H), 1.86 及 1.77(二 d, 1H), 1.45(m, 1H), 1.38-1.10(m, 6H), 0.85 及 0.74(二 t, 6H).
29.214 syn:anti =	非晶形	syn 成分資料： 8.52(m, 1H), 8.29(d, 1H), 8.16(br, 1H), 7.83(d, 1H),

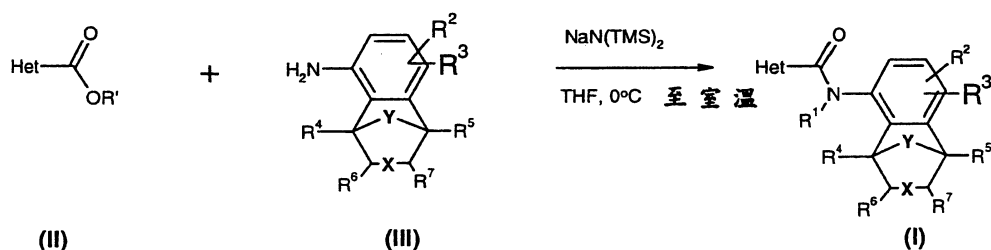
74:26		7.43(d, 1H), 7.16(t, 1H), 7.05(d, 1H), 3.30(m, 1H), 3.19(m, 1H), 1.98(m, 2H), 1.80-0.8(m, 12H).
29.218 syn:anti = 88:12	非晶形	
29.230	非晶形	8.53(m, 1H), 8.29(d, 1H), 8.17(br, 1H), 7.71(d, 1H), 7.43(m, 1H), 7.13(t, 1H), 7.06(d, 1H), 3.91(m, 1H), 3.82(m, 1H), 1.93(m, 2H), 1.63(s, 6H), 1.40-1.23(m, 2H).
29.231	非晶形	8.53(m, 1H), 8.26(d, 1H), 8.16(br, 1H), 7.73(d, 1H), 7.43(m, 1H), 7.13(t, 1H), 7.05(d, 1H), 3.91(m, 1H), 3.81(m, 1H), 2.1-1.89(m, 6H), 1.40-1.23(m, 2H), 0.93(m, 6H).

【實施方式】

式(I)化合物可根據如下反應圖製備。

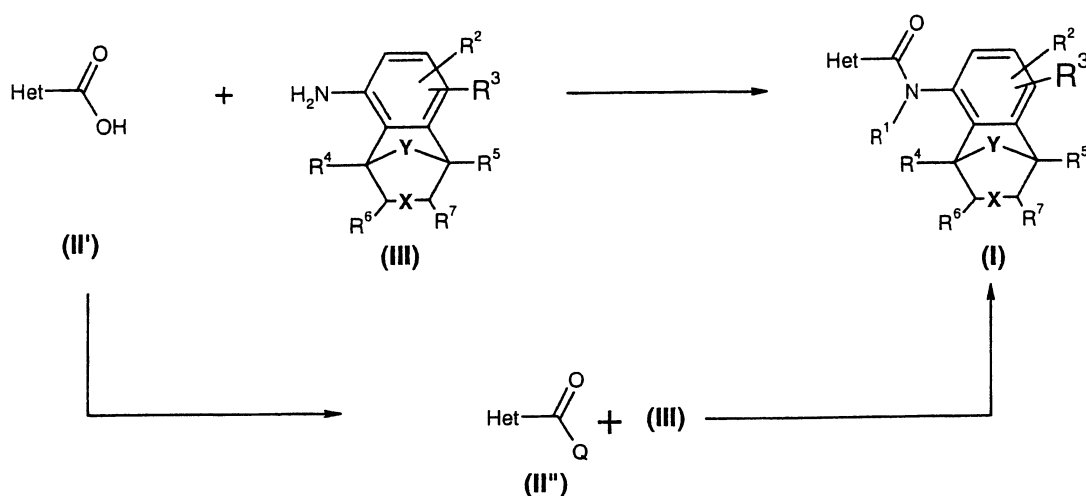
式(I)化合物之製備

反應圖 1



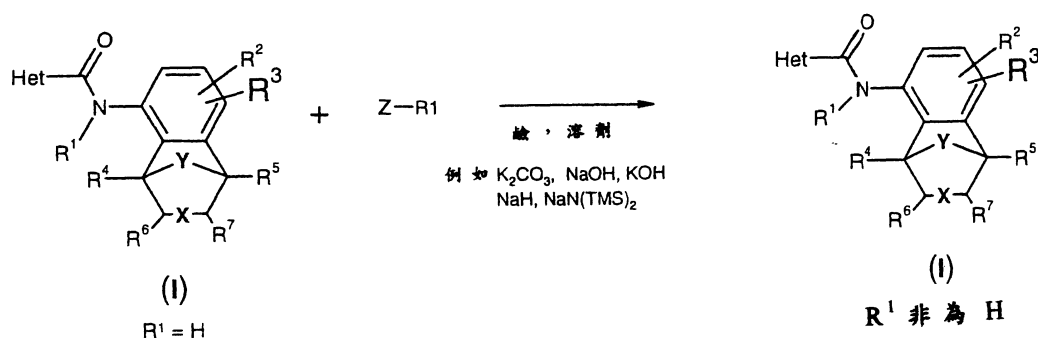
式(I)化合物[此處 R^1 為氫；以及Het、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、X及Y定義如上式(I)化合物]之合成方式係經由化合物(II)[此處Het定義如上式(I)化合物以及 R^1 為 C_{1-5} 烷基]與式(III)苯胺[此處 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、X及Y定義如上式(I)化合物]，於 $\text{NaN}(\text{TMS})_2$ 存在下，於 -10°C 至周圍溫度且較佳於無THF如J. Wang等人Synlett, 2001, 1485所述反應而合成。

反應圖 2



另外，式(I)化合物[此處R¹為氫；以及Het、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、X及Y定義如上式(I)化合物]之製備方法，可經由式(II')化合物[此處Het定義如上式(I)化合物]與式(III)苯胺[此處R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、X及Y定義如上式(I)化合物]，於活化劑[如BOP-Cl]以及2當量鹼[如三乙基胺]存在下反應而製備；或經由式(II'')化合物[此處Het定義如上式(I)化合物；以及Q為Cl、F或Br]，其係由式(II')化合物經由使用鹵化劑(如亞磺醯氯、草醯氯、光氣、SF₄、DAST、狄奧克索夫洛(Deoxofluor)或亞磺醯溴)處理獲得，經由該(II'')化合物與式(III)苯胺[此處R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、X及Y定義如上式(I)化合物]於1當量鹼[如NEt₃、NaHCO₃、KHCO₃、Na₂CO₃或K₂CO₃]存在下於溶劑[如二氯甲烷、乙酸乙酯或DMF]較佳於-10°C至30°C反應而製備。

反應圖 3



此外，式(I)化合物[此處R¹為氫；以及Het、R²至R⁷、X及Y定義如式(I)化合物]與Z-R¹物種[此處R¹定義如式(I)，但R¹非為氫；以及Z較佳為Cl、Br或I；或Z讓Z-R¹為酰，換言之當R¹為COR*時，Z為OCOR*]於鹼[例如NaH、NEt₃、NaHCO₃或K₂CO₃]存在下，於適當溶劑[如乙酸乙酯]，或於雙相混合物[如二氯甲烷/水混合物]，於-10°C至30°C反應。

起始物料

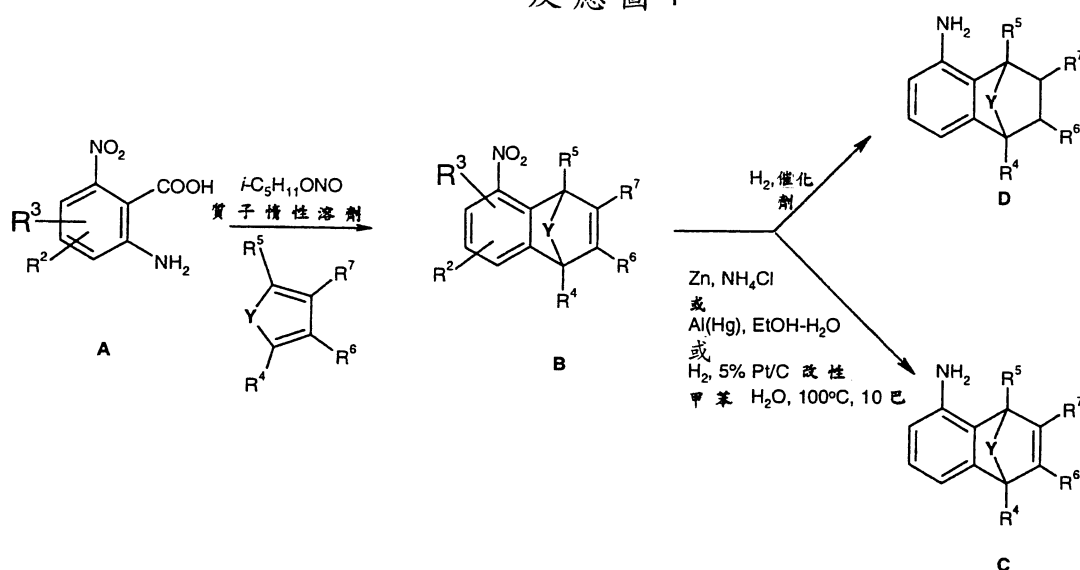
雜環酸及酯[亦即式(II')或(II)化合物]通常由參考文獻為已知，或可根據已知方法合成。

式(C)或(D)鄰位經取代之胺基苯并原冰片烯(包括同系物)(反應圖4)可經由原位產生的苯[例如始於式(A) 6-硝基胺苧酸，如L. Paquette等人，美國化學會期刊99，3734(1977)所述；或始於其它適當前驅物(例如參考H. Pellissier等人四面體，59，701(2003))]進行狄爾斯-阿爾德加成反應(Diels-Alder addition)，加成至5-7員環狀1,4-二烯，獲得式(B)硝基苯并原冰片二烯，該反應係根據或類似L. Paquette等人，美國化學會期刊，99，3734(1977)，D. Gravel等人，加拿大化學期刊69，1193(1991)，J.R. Malpass等人，

四面體，48，861 (1992)，D.E. Lewis等人，合成通訊，23，993 (1993)，R.N. Warrenner等人分子，6，353 (2001)，R.N. Warrenner等人分子，6，194 (2001)或I. Fleming等人化學會期刊，Perkin Trans.1，2645 (1998)。供此步驟使用之適當質子惰性溶劑包括乙酸乙酯、二氯甲烷、丙酮、THF及二甲氧基乙烷。反應溫度為室溫至100°C，且較佳為40-80°C。

隨後，式(B)化合物之硝基選擇性還原而獲得式(C)胺基-苯并原冰片二烯要求溫和條件[例如金屬鋅於氯化銨或鋁汞齊存在下]。兩種方法皆於質子性溶劑如乙醇、水或其混合物進行。另外，式(C)化合物也可得自式(B)化合物，係經由使用改性5% Pt/C催化劑於升高壓力(約10巴)以及於升高溫度(約100°C)，於甲苯-水催化氫還原式(B)化合物獲得。於標準條件(例如5% Pd/C或5% Ra/Ni或5% Rh/C)於溶劑[例如甲醇、乙醇、THF或乙酸乙酯]之催化還原可將硝基及雙鍵二者還原而獲得式(D)苯并原冰片烯。較佳反應條件為周圍溫度及常壓。

反應圖4



若干式(B)、(C)及(D)化合物述於參考文獻[例如參考L. A. Paquette等人，美國化學會期刊，99，3734 (1977)，D. Gravel等人，加拿大化學期刊69，1193 (1991)；T. Nishiyama等人，理化學篇28，37 (2000)；H. Plieninger等人，Chem. Ber. 109，2121 (1976)；及A. J. Kirby等人，化學會期刊，Perkin Trans. 2，1997，1081]。

新穎式(C)或(D)起始化合物可經由類似反應圖4或根據前文引用之參考文獻合成。

出乎意外地，今日發現新穎式(I)化合物供實際應用目的，具有極為有利之活性範圍，可保護植物對抗由真菌及細菌及病毒引發的疾病。

式(I)化合物可用於農藝領域以及相關使用領域作為控制植物病蟲害的活性成分。新穎化合物特殊之處在於以低施用率及具有絕佳活性，植物之忍受性良好，以及對環保安全。新穎式(I)化合物具有極為有用之治療、預防及系統性質，而可用於保護多種栽種植物。式I化合物可用於抑制或摧毀出現於多種有用農作物之植株或植株部分(果實、花序、葉、莖、塊莖、根)之病蟲害，且同時保護該等後來生長之植株部分不會受到例如植物病原微生物之害。

也可使用式(I)化合物作為敷料用來處理植物繁殖物質，特別種子(果實、塊莖、穀物)以及植物插枝(例如稻米)，用來保護不受真菌感染，以及對抗出現於土壤的病原性真菌。

此外，本發明化合物可用於相關領域用於控制真菌，例如用於保護技術性材料，包括木材及木材相關之技術性產

品、用於食品的儲存以及用於衛生管理等。

式(I)化合物例如可有效對抗以下各類植物病原性真菌：真菌半知菌(Fungi imperfecti)(例如葡萄孢(Botrytis)、Pyricularia、長蠕孢(Helminthosporium)、鐮孢(Fusarium)、殼針孢(Septoria)、尾孢(Cercospora)及鏈格孢(Alternaria))及擔子菌綱(Basidiomycetes)(例如絲核菌(Rhizoctonia)、駝孢銹菌(Hemileia)、柄銹菌(Puccinia))。此外，式(I)化合物也可有效對抗子囊菌綱(Ascomycetes)(例如黑星菌(Venturia)及白粉菌(Erysiphe)、叉絲單囊殼(Podosphaera)、鏈核盤菌(Monilinia)、鉤絲殼(Uncinula))以及卵菌綱(Oomycetes)(例如疫霉(Phytophthora)、腐霉(Pythium)、單軸霉(Plasmopara))。對粉霉(白粉菌屬)觀察得絕佳活性。此外，新穎式I化合物可有效對抗植物病原性細菌及病毒(例如對抗黃單胞菌屬(Xanthomonas spp)、假單胞菌屬(Pseudomonas spp)、澱粉分解歐文氏菌(Erwinia amylovora)以及對抗菸草嵌紋病毒)。

於本發明範圍，欲保護之目標作物典型包含下列各種植物：穀類(小麥、大麥、裸麥、燕麥、稻米、玉米、高粱及相關種屬)；甜菜類(甜菜以及飼料用甜菜)；梨果類、核果類及無核果類(蘋果、梨、梅李、桃、杏、櫻桃、草莓、覆盆子及黑莓)；豆科植物(豆、刀豆、彎豆、大豆)；油用植物(油菜、芥菜、罌粟、橄欖、葵花、椰子、蓖麻油植物、可可豆、花生)；瓜類植物(南瓜類、黃瓜類、甜瓜類)；纖維植物(棉、亞麻、大麻、黃麻)；柑橘水果(柳橙、檸檬、

葡萄柚、橘子)；蔬菜(菠菜、萵苣、蘆筍、甘藍、胡蘿蔔、洋蔥、蕃茄、馬鈴薯、紅辣椒)；月桂科(鰐梨、肉桂、樟腦)或菸草、核果、咖啡、茄子、甘蔗、茶、胡椒、葡萄、蛇麻草、香蕉等植物，以及天然橡膠植物及觀賞用植物。

式(I)化合物可以未經改性形式使用，或較佳連同習用於調配業界的輔劑使用。為了達成此項目的，式(I)化合物可方便地以已知方式調配成可乳化濃劑、可塗覆糊劑、可直接噴霧溶液劑或可稀釋溶液劑、稀乳液劑、可濕潤散劑、可溶性散劑、塵粉劑、粒劑以及包囊例如包囊於聚合物物質。至於組合物類別、施用方法例如噴霧、霧化、撒佈、散開、塗覆或傾倒係根據期望目的以及周圍環境選用。組合物也含有其它輔劑例如安定劑、消泡劑、黏度調節劑、黏結劑或增黏劑以及肥料、微量營養素施體或其它含有特殊效果之調配物。

適當載劑及輔劑可為固體或液體，且為可用於調配技術之物質，例如天然或再生礦物、溶劑、分散劑、濕潤劑、增黏劑、增稠劑、黏結劑或肥料。此等載劑例如述於WO97/33890。

式(I)化合物通常係以組合物形式使用，且可與其它化合物同時或接續施用於欲處理的農作區或農作物。此等其它化合物可為例如肥料或微量營養素施體或其它可影響植物生長之製劑。此等其它化合物也可為選擇性殺草劑以及殺蟲劑、殺真菌劑、殺菌劑、殺線蟲劑、殺軟體動物劑或若干此等製劑之混合物，若有所需連同其它調配業界習常使

用之載劑、界面活性劑或應用增進輔劑。

式(I)化合物可混合其它殺真菌劑，結果於某些情況下獲得出乎意外的協同活性。特佳之混合成分為唑類例如亞占康納佐(azaconazole)、BAY 14120、必特塔諾(bitertanol)、伯目康納佐(bromuconazole)、賽普洛康納佐(cyproconazole)、第芬可納佐(difenconazole)、第尼康納佐(diniconazole)、伊波西康納佐(epoxiconazole)、芬布康納佐(fenbuconazole)、富昆康納佐(fluquinconazole)、富西拉佐(flusilazole)、富翠亞弗(flutriafol)、海沙康納佐(hexaconazole)、伊馬查利(imazalil)、伊米本康納佐(imibenconazole)、伊普康納佐(ipconazole)、美康納佐(metconazole)、麥可洛布塔尼(myclobutanil)、沛富拉佐特(pefurazoate)、片康納佐(penconazole)、派利芬諾斯(pyrifenoxy)、普克洛拉茲(prochloraz)、普洛皮康納佐(propiconazole)、西美康納佐(simeconazole)、特布康納佐(tebuconazole)、特查康納佐(tetraconazole)、翠亞第梅芬(triadimefon)、翠亞第梅諾(triadimenol)、翠富麥佐(triflumizole)、翠提康納佐(triticonazole)；嘧啶卡畢醇如安西米多(ancymidol)、芬拿利莫(fenarimol)、紐亞利莫(nuarimol)；2-胺基嘧啶類例如布皮利梅(bupirimate)、第梅西利莫(dimethirimol)、伊西利莫(ethirimol)；嗎啉類例如多德莫夫(dodemorph)、芬普羅皮定(fenpropidine)、芬普羅皮莫夫(fenpropimorph)、史派洛沙明(spiroxamine)、翠德莫夫(tridemorph)；苯胺基嘧啶類例如賽普羅第尼(cyprodinil)、梅潘尼派利(mepanipyrim)

、派利梅沙尼(pyrimethanil)；吡咯類例如芬皮克洛尼(fenpiclonil)、富第歐索尼(fludioxonil)；苯基醯胺類例如本納拉西爾(benalaxyl)、富勒拉西爾(furalaxyl)、梅他拉西爾(metalaxyl)、R-梅他拉西爾(R-metalaxyl)、歐富瑞(ofurace)、歐沙第西爾(oxadixyl)；苯并咪唑類例如苯諾米爾(benomyl)、卡本達金(carbendazim)、迪巴卡(debacarb)、富伯利達佐(fuberidazole)、賽本達佐(thiabendazole)；二羧醯亞胺類例如克洛左利內(chlozolate)、第克洛左林(dichlozoline)、伊普第歐(iprodione)、麥可洛左林(myclozoline)、普洛賽米東(procymidone)、文可洛左林(vinclozoline)；羧醯胺類例如卡波辛(carboxin)、芬富蘭(fenfuram)、富托拉尼(flutolanil)、梅普洛尼(mepronil)、歐西卡波辛(oxycarboxin)、西富查麥(thifluzamide)；脲類例如瓜查汀(guazatine)、多定(dodine)、伊米諾塔汀(iminoctadine)；strobilurines例如亞左西多必(azoxystrobin)、克雷索辛(kresoxim)-甲基、梅托米諾查必(metominostrobin)、SSF-129、翠富洛查必(trifloxystrobin)、皮可西查必(picoxystrobin)、BAS 500F(擬議名稱皮拉洛查必(pyraclostrobin))、BAS 520；二硫基胺基甲酸酯類例如弗班(ferbam)、曼可瑞(mancozeb)、曼內(maneb)、梅提蘭(metiram)、普皮內(propineb)、西蘭(thiram)、齊內(zineb)、日蘭(ziram)；N-鹵甲硫基四氫苯二甲醯亞胺類例如卡塔弗(captafol)、卡坦(captan)、第可洛富亞尼(dichlofluanid)、富洛麥(fluoromides)、弗沛(folpet)、托利富亞尼

(tolyfluanid)；銅化合物例如波爾多混合物、氫氧化銅、銅醯氯、硫酸銅、氧化亞銅、曼可波(mancopper)、歐辛可波(oxine-copper)；硝基酚衍生物例如迪諾凱(dinocap)、奈多沙(nitrothal)-異丙基；有機磷衍生物例如伊第芬弗(edifenphos)、伊普本弗(iprobenphos)、伊索普賽蘭(isoprothiolane)、弗斯第芬(phosdiphen)、派拉左弗(pyrazophos)、托克洛弗(tolclofos)-甲基；多種其它化合物例如亞西本左拉(acibenzolar)-S-甲基、亞尼拉占(anilazine)、本賽瓦利卡(benthiavalicarb)、布拉提西定(blasticidin)-S、齊諾梅西歐內(chinomethiomnate)、克洛羅內(chloroneb)、克洛羅沙洛尼(chlorothalonil)、賽富芬納麥(cyflufenamid)、賽莫沙尼(cymoxanil)、第克隆(dichlone)、第可洛梅辛(diclomezine)、第可洛蘭(dicloran)、第索芬卡(diethofencarb)、第梅索莫夫(dimethomorph)、SYP-LI90(擬議名稱：富莫夫(flumorph))、第沙諾(dithianon)、伊沙波山(ethaboxam)、亞翠第佐(etridiazole)、法莫沙東(famoxadone)、芬納米東(fenamidone)、芬諾沙尼(fenoxanil)、芬汀(fentin)、費利莫宗(ferimozone)、富亞日南(fluzinam)、富沙法麥(flusulfamide)、芬海沙米(fenhexamid)、弗塞他(fosetyl)-鋁、海梅沙佐(hymexazol)、伊普瓦利卡(iprovalicarb)、IKF-916(賽亞卓法麥(cyazofamid))、卡素格黴素(kasugamycin)、美沙索弗卡(methasulfocarb)、美多芬諾(metrafenone)、尼可必芬(nicobifen)、片賽庫倫(pencycuron)、弗沙利(phthalide)、波利歐克辛(polyoxins)

、普本納佐(probenazole)、普帕莫卡(propamocarb)、派洛奎隆(pyroquilon)、奎諾西芬(quinoxifen)、昆托金(quintozene)、硫、翠亞左賽(triazoxide)、翠賽可拉佐(tricyclazole)、翠弗林(triforine)、瓦利達黴素(validamycin)、左沙麥(zoxamide)(RH7281)。

較佳施用式(I)化合物之方法，或施用含有至少一種式(I)化合物之農用化合物之方法為葉部施用。施用頻率以及施用率將依據植物受到對應病原侵擾的風險決定。但式I化合物也可藉使用液體調配物灌溉植物所在位置而透過土壤經過根部穿透全體(系統性作用);或呈固體形式施用化合物至土壤，例如以粒劑形式施用(土壤施用)。用於水稻農作物，此等粒劑可施用至灌溉水田。式I化合物也可經由種子或塊莖浸泡於殺真菌劑之液體調配物或使用固體調配物塗覆種子或塊莖而施用於種子(塗覆)。

調配物[亦即含有式(I)化合物之組合物]以及若有所需固體或液體輔劑係以已知方式製備，典型係經由緊密混合及/或研磨化合物與增量劑如溶劑、固體載劑、以及選擇性其表面活性化合物(界面活性劑)而製備。

農化調配物通常含有0.1至99%重量比，且較佳0.1至95%重量比式I化合物，99.9至1%重量比，且較佳99.8至5%重量比固體或液體佐劑，以及0至25%重量比，且較佳0.1至25%重量比界面活性劑。

較佳施用率為每公頃(ha)5克至2千克活性成分(a.i.)，較佳為10克至1千克a.i./ha，最佳為20克至600克a.i./ha。當用

作為種子濕透劑時，方便劑量為每千克種子使用10毫克至1克活性物質。

雖然較佳將商品調配為濃劑，但最終使用者通常係使用稀釋調配物。

下列非限制性實施例舉例說明前述發明之進一步細節。

實施例1

本例說明化合物編2.01之製備。

1,4-二甲基-5-硝基-1,4-二氫-1,4-環氧基萘(5.49克；25.27毫莫耳)(參考T. Nishiyama等人，理化篇，28，37-43(2000))於THF(55毫升)之溶液於周圍溫度於阮尼鎳(1.1克)存在下氫化。18小時後吸收之氫為2.23升(97%)。過濾去除催化劑後，濾液經蒸發，攝取於醚，以水性碳酸氫鈉溶液洗滌及脫水(硫酸鈉)，獲得4.60克粗產物呈油。使用己烷以及微量醚濕磨，共獲得4.51克(94%)紅色結晶產物。

實施例2

本例說明化合物編號1.01之製備。

於1,4-二甲基-5-硝基-1,4-二氫-1,4-環氧基萘(4.22克；19.43毫莫耳)(參考實施例1)於乙醇(60毫升)於47°C加入氯化銨(2.08克)於水(5.2毫升)之溶液。激烈攪拌後，鋅粉(9.10克；0.14莫耳)以5分鐘時間分成數份添加。懸浮液加熱至回流經5½小時時間，接著經海夫洛(Hyflo)TM過濾獲得澄清黃色濾液。蒸發後，粗產物為4.57克黏稠油。於矽膠以乙酸乙酯-己烷(1：4)管柱層析術，獲得1.24克(34%)所需產物，呈褐色晶體。

實施例3

本例說明化合物編號2.16之製備。

5-硝基苯并原冰片二烯(L. A. Paquette等人，美國化學會期刊99，3734 (1977))(2.52克；13.46毫莫耳)於甲醇(100毫升)之溶液於周圍溫度於5% Pd/C (0.5克)存在下氫化。11分鐘後氫氣之吸收為1.14升(95%)。由催化劑過濾出溶液，及蒸發獲得純產物(1.86克；87%)，呈黃色油，油於室溫放置時固化(熔點63-64°C)。

實施例4

本例說明化合物編號3.023之製備。

1-甲基-4-三氟甲基-1H-吡咯-3-羧酸(1.02克；5.3毫莫耳)及催化量之DMF(3滴)於二氯甲烷(20毫升)之溶液於初步冰冷使用草醯氯(0.805克；1.2當量)反應2小時。15分鐘內，反應混合物於冷卻(3-7°C)下逐滴添加至1,8-二甲基-11-氧雜-參環[6.2.1.0*2,7*]十一碳-2,4,6-三烯-3-基胺(化合物編號2.01；參考前述製備)(1.0克；5.284毫莫耳)以及三乙基胺(1.07克；10.57毫莫耳)於20毫升二氯甲烷之溶液，隨後於周圍溫度攪拌3¼小時。然後反應混合物倒至冰水上，使用二氯甲烷萃取，獲得2.26克粗產物。於矽膠於乙酸乙酯-己烷(1：1)純化，接著使用醚-己烷濕磨，獲得固體(1.14克；59%)，呈異構物混合物。

實施例5

本例說明化合物編號3.024之製備。

氫化鈉(0.107克；60%油分散液，約2.7毫莫耳)於DMF(5

毫升)之懸浮液與1-甲基-4-三氟甲基-1H-吡咯-3-羧酸(1,8-二甲基-11-氧雜-參環[6.2.1.0*2,7*]十一碳-2,4,6-三烯-3-基)醯胺(化合物編號3.023; 參考前述製備)(0.65克; 1.784毫莫耳)於5毫升DMF之溶液於10-15°C反應30分鐘。加入3-溴-1-丙炔(0.276克; 2.32毫莫耳), 混合物又於周圍溫度反應隔夜。使用冰水及乙酸乙酯水性後續處理以及於矽膠純化後, 獲得0.36克(50%)所需產物, 呈異構物混合物。

式(I)化合物之調配例

製備式I化合物之調配物例如可乳化濃劑、溶液劑、粒劑、塵粉劑及可濕潤散劑之實施例述於WO97/33890。

生物例：殺真菌作用

實施例B-1：對抗隱匿柄銹菌(Puccinia recondita)/小麥(小麥褐銹病)之作用

1週齡小麥株變種亞利納(Arina)於噴霧室內使用調配後之試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用後1日, 小麥株藉噴霧孢子懸浮液(1×10^5 夏孢子/毫升)於試驗植株而接種菌種。於20°C以及95%相對濕度維持2日的接種期後, 植株維持於20°C及60%相對濕度之溫室8日。接種後10日評比發病率。

使用化合物3.048、14.048、29.048、15.048、20.048、3.028、22.048、21.048、15.023、15.027、15.028、3.035、14.035、15.035、15.052、14.210、15.210、14.202及15.202實質上可完全避免侵擾(0-5%侵擾)。

實施例B-2：對抗白叉絲單囊殼(Podosphaera leucotricha)/

蘋果(蘋果粉霉)之作用

5週齡蘋果幼苗變種麥金塔(McIntosh)於噴霧室內使用經調配的試驗化合物(0.02%活性成分)處理。1日後，經施用的蘋果株藉將感染蘋果粉霉的植物於該試驗株上方搖動而接種菌種。於22°C以及60%相對濕度，於14/10小時亮/暗的照明計畫經12日培養期後，評比發病率。

化合物3.048、14.048、15.048、20.048、14.210、15.210、14.202、15.202及15.023具有強力功效(<20%侵擾)。

實施例B-3：對抗蘋果黑星菌(*Venturia inaequalis*)/蘋果(蘋果瘡痂病)之作用

4週齡蘋果幼苗變種麥金塔於噴霧室內使用調配後之試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用後1日，蘋果株藉噴霧孢子懸浮液(4×10^5 分生孢子/毫升)於試驗植物上而接種。於21°C及95%相對濕度經4日培養期後，蘋果株置於21°C及60%相對濕度之溫室內4日。於21°C及95%相對濕度又經4日培養期後，評比發病率。

化合物3.048、14.048、14.210、15.210、14.202、15.202及15.048皆具有強力功效(<20%侵擾)。

實施例B-4：對抗褐白粉菌(*Erysiphe graminis*)/大麥(大麥粉霉)之作用

1週齡大麥株變種雷吉納(Regina)於噴霧室內使用調配後之試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用後1日，大麥株經由將粉霉感染的大麥植株於試驗株上方搖動而接種。於20°C/18°C(日/夜)以及60%相對濕度之溫室內經6日培養

期後，評比發病率。

化合物 3.023、14.023、3.048、14.048、15.048、3.027、3.028、15.023、14.210、15.210、14.202、15.202 及 15.027 皆具有強力功效(<20%侵擾)。

實施例 B-5：對抗灰葡萄孢(Botrytis cinerea)/葡萄(葡萄之葡萄孢病)之作用

5週齡葡萄幼苗變種古特多(Gutedel)於噴霧室內使用調配後之試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用後2日，葡萄株藉噴霧孢子懸浮液(1×10^6 分生孢子/毫升)於試驗植株上而接種。於21°C及95%相對濕度之溫室內經4日培養期後，評比發病率。

化合物 14.048、15.048、3.028、14.210、15.210、14.202、15.202 及 15.027 各自於本試驗顯示良好活性(<50%發病率)。

實施例 B-6：對抗灰蕃茄孢/蕃茄(蕃茄之蕃茄孢病)之作用

4週齡蕃茄株變種羅特吉諾(Roter Gnom)於噴霧室內使用調配後之試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用後2日，蕃茄株藉噴霧孢子懸浮液(1×10^5 分生孢子/毫升)於試驗植株上而接種。於20°C及95%相對濕度之溫室內經4日培養期後，評比發病率。

化合物 3.048、3.052、14.052、15.048、14.210、15.210、14.202、15.202 及 15.023 各自顯示良好功效(<50%發病率)。

實施例 B-7：對抗穎枯殼針孢(Septoria nodorum)/小麥(小麥殼針孢葉斑病)之作用

1週齡金麥株變種亞利納於噴霧室內使用調配後之試驗

化合物(0.02%活性成分)處理。施用後1日，小麥株藉噴霧孢子懸浮液(5×10^5 分生孢子/毫升)於試驗株上而接種。於20°C及95%相對濕度為期1日之接種期後，小麥株於20°C及60%相對濕度之溫室內維持10日。接種11日後評比發病率。

化合物3.002、3.048、14.048、14.210、15.210、14.202、15.202及15.048於本試驗各自顯示良好活性(<50%發病率)。

實施例 B-8：對抗大麥網斑長蠕孢 (Helminthosporium teres)/大麥(大麥網斑病)之作用

1週齡大麥株變種雷吉納於噴霧室內使用調配後之試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用後2日，大麥株藉噴霧孢子懸浮液(3×10^4 分生孢子/毫升)於試驗株上而接種。於20°C及95%相對濕度於溫室經4日培養期後，評比發病率。

化合物3.023、14.023、3.048、14.048、15.048、3.027、15.023、15.027、14.210、15.210、14.202、15.202及15.028於本試驗顯示良好活性(<20%發病率)。

實施例 B-9：對茄鏈格孢 (Alternaria solani)/蕃茄(蕃茄草疫病)之作用

4週齡蕃茄株變種羅特吉諾於噴霧室內使用經調配之試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用後2日，蕃茄株藉噴霧孢子懸浮液(2×10^5 分生孢子/毫升)於試驗株接種。於20°C及95%相對濕度之生長室維持3日之培養期後，評比發病率。

化合物3.023、14.023、3.048、14.048、14.210、15.210、14.202、15.202及15.048於本試驗顯示良好活性(<20%發病率)。

實施例 B-10：對抗葡萄鉤絲殼 (*Uncinula necator*)/ 葡萄 (葡萄粉霉) 之作用

5週齡葡萄幼苗變種古特多於噴霧室內使用經調配之試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用後1日，葡萄株經由將感染葡萄粉霉之葡萄株於試驗株上方振搖而接種菌種。於26°C及60%相對濕度於14/10小時(亮/暗)之照明計畫下經7日培養期後，評比發病率。

化合物 14.048、15.048、14.028及15.023於本試驗顯示良好活性(<20%發病率)。

實施例 B-11：對抗褐白粉菌/大麥 (大麥粉霉) 之系統性作用 (套袋試驗)

經調配之試驗化合物(0.002%活性成分)施用於事先裝配濾紙的袋內。施用後，大麥種子(變種伊克斯普雷斯 (Express))播種於濾紙的上斷層。然後準備好的袋子於23°C/18°C(日/夜)以及80%相對濕度培養。播種後1週，大麥株經由將感染有粉霉的大麥株於試驗株的上方振搖而接種。經6日培養期後，評比發病率。各試驗化合物的功效用作為系統活性指標。

化合物 14.024、3.002、3.048、29.048、3.027、22.048、21.048、15.023、15.027、15.028及15.035於本試驗顯示良好活性(<50%發病率)。

實施例 B-12：對抗大刀鐮孢 (*Fusarium culmorum*)/ 小麥 (小麥鐮孢頭疫病) 之作用 (套袋試驗)

大刀鐮孢分生孢子懸浮液(7×10^5 分生孢子/毫升)混合經

調配之試驗化合物(0.002%活性成分)。混合物施用於袋子內，袋子事先裝配濾紙。施用後，小麥種子(變種歐里斯提斯(Orestis))播種於濾紙的上斷層。然後製備妥的袋子於約10-18°C以及100%相對濕度使用白晝照明時間14小時培養11日。以根部的褐病變形式評比疾病發生程度進行評估。

化合物14.024、15.048、20.048、14.027、24.048及3.035於本試驗各自顯示良好活性(<50%發病率)。

實施例B-13：對抗禾頂囊殼(Gaeumannomyces graminis)/小麥(小麥全蝕病)之作用(套袋試驗)

預定量之禾頂囊殼菌絲體混合水。調配後之試驗化合物(0.002%活性成分)添加至菌絲體懸浮液。混合物施用至事先裝配有濾紙的袋子內。於施用後，小麥種子(變種歐里斯提斯)播種於濾紙的上斷層。製備妥的袋子於18°C/16°C(日/夜)以及80%相對濕度，以白晝照明時間14小時培養14日。經由評比根部褐變程度來做評估。

化合物15.048、20.048、21.048、15.028及15.052於本試驗各自顯示良好活性(<50%發病率)。

實施例B-14：對抗隱匿病銹菌/小麥(小麥褐銹病)之作用(套袋試驗)

調配後之試驗化合物(0.002%活性成分)施用於事先裝配濾紙袋子內。施用後，小麥種子(變種亞利納)播種於濾紙上斷層。製備妥之袋子隨後於23°C/18°C(日/夜)以及80%相對濕度培養。播種後1週，小麥株藉噴霧孢子懸浮液(1×10^5 夏孢子/毫升)於試驗株上而接種。於23°C以及95%相對濕度之

培養期後，小麥株於20°C /18°C (日/夜)以及80%相對濕度維持9日。接種後10日評比發病率。各試驗化合物功效用作為系統活性指標。

化合物 14.024、3.002、14.002、15.048、20.048、3.027、22.048、15.023、15.027、15.028、3.035、14.035及15.035於本試驗各自顯示良好活性(<50%發病率)。

實施例B-15：對抗立枯絲核菌菌絲體(Rhizoctonia solani) /稻米(稻米鞘疫病)之作用(套袋試驗)

預定量之立枯絲核菌菌絲體混合水。調配後之試驗化合物(0.002%活性成分)添加至菌絲體懸浮液。混合物施用至事先裝配有濾紙的袋子內。於施用後，稻米種子(變種寇希卡利(Koshihikari))播種於濾紙的上斷層。製備妥的袋子於23°C /21°C (日/夜)以及100%相對濕度，以白晝照明時間14小時培養10日。經由以根部的褐病變形式評比疾病發生程度進行評估。

化合物 3.048、14.048、29.048、3.052、29.052、14.052、15.048、20.048、3.027、14.028、22.048、21.048、4.408、15.023、3.035、14.035及15.035於本試驗各自顯示良好活性(<50%發病率)。

實施例B-16：對穎枯殼針孢/小麥(小麥殼針孢葉斑病)之作用(套袋試驗)

經調配之試驗化合物(0.002%活性成分)施用於事先裝配濾紙的袋內。施用後，小麥種子(變種亞利納)播種於濾紙的上斷層。然後準備好的袋子於23°C /18°C (日/夜)以及80%相

對濕度培養。播種後1週，小麥株藉噴霧孢子懸浮液(5×10^5 分生孢子/毫升)於試驗株的上接種。於23°C以及95%相對濕度經1日之培養期後，小麥株於20°C/18°C(日/夜)以及80%相對濕度維持9日。接種後8日評比發病率。各試驗化合物的功效用作為系統活性指標。

化合物3.048、29.048、15.048、14.027、15.023及15.027本試驗各自顯示良好活性(<50%發病率)。

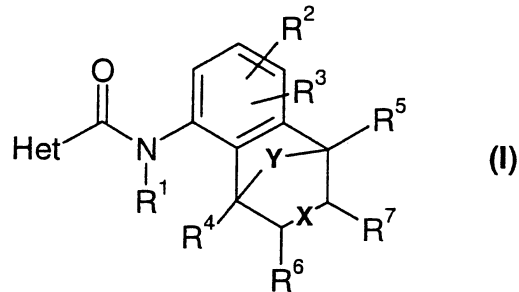
實施例B-17: 對小麥殼針孢(Septoria tritici)/小麥(小麥殼針孢葉斑病)之作用(套袋試驗)

2週齡小麥變種利班(Riband)於噴霧室內使用調配後之試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用後1日，小麥株藉噴霧孢子懸浮液(10×10^5 分生孢子/毫升)於試驗株上而接種。於23°C以及95%相對濕度經1日培養期後，小麥株於23°C以及60%相對濕度之溫室內維持16日。接種後18日評比發病率。

化合物14.202、或14.210於本試驗各自顯示良好活性(<20%發病率)。

伍、中文發明摘要：

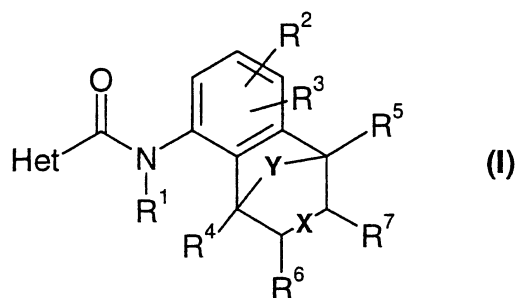
本發明係有關一種式(I)殺真菌活性化合物：



此處Het為含1至3個各自分別選自氧、氮及硫之雜原子之5-員或6-員雜環族環，但該環非為1,2,3-三唑，該環經以R⁸、R⁹及R¹⁰基團取代；X為單鍵或雙鍵；Y為O、S、N(R¹¹)或(CR¹²R¹³)(CR¹⁴R¹⁵)_m(CR¹⁶R¹⁷)_n；m為0或1；n為0或1；以及R¹至R¹⁷各自分別具有某個範圍之值；本發明亦係關於此等化合物之製備，關於用於製備此等化合物之新穎中間物，關於包含至少一種新穎化合物作為活性成分之農業化學組合物，關於所述組合物之製備，以及關於該等活性成分或組合物用於農藝或園藝控制或預防植物受到植物病原性微生物如真菌的侵擾之用途。

陸、英文發明摘要：

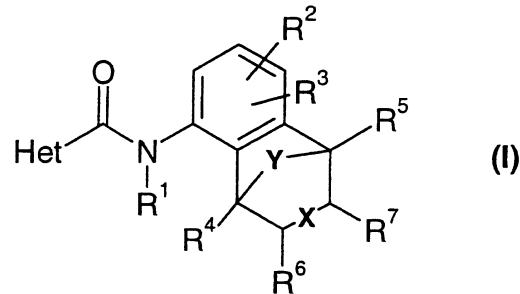
The invention relates to a fungicidally active compound of formula (I):



where Het is a 5- or 6-membered heterocyclic ring containing one to three heteroatoms, each independently selected from oxygen, nitrogen and sulphur, provided that the ring is not 1,2,3-triazole, the ring being substituted by groups R^8 , R^9 and R^{10} ; X is a single or double bond; Y is O, S, $N(R^{11})$ or $(CR^{12}R^{13})(CR^{14}R^{15})_m(CR^{16}R^{17})_n$; m is 0 or 1; n is 0 or 1; and R^1 to R^{17} each, independently, have a range of values; to the preparation of these compounds, to novel intermediates used in the preparation of these compounds, to agrochemical compositions which comprise at least one of the novel compounds as active ingredient, to the preparation of the compositions mentioned and to the use of the active ingredients or compositions in agriculture or horticulture for controlling or preventing infestation of plants by phytopathogenic microorganisms, preferably fungi.

拾、申請專利範圍：

1. 一種式(I)化合物：

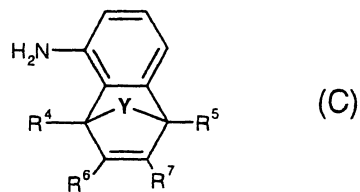


此處Het為含1至3個各自分別選自氧、氮及硫之雜原子之5員或6員雜環族環，但該環非為1,2,3-三唑，該環經以 R^8 、 R^9 及 R^{10} 基團取代；X為單鍵或雙鍵；Y為O、S、N(R^{11})或 $(CR^{12}R^{13})(CR^{14}R^{15})_m(CR^{16}R^{17})_n$ ；m為0或1；n為0或1； R^1 為氫、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、 $CH_2C \equiv CR^{18}$ 、 $CH_2CR^{19}=CHR^{20}$ 、 $CH=C=CH_2$ 或 COR^{21} ； R^2 及 R^3 各自分別為氫、鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基或 C_{1-4} 鹵烷氧基； R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 各自分別為氫、鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{1-4} 鹵烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{1-4} 鹵烷硫基、羥基甲基、 C_{1-4} 烷氧基甲基、 $C(O)CH_3$ 或 $C(O)OCH_3$ ； R^8 、 R^9 及 R^{10} 各自分別為氫、鹵素、氰基、硝基、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})伸烷基或 C_{1-4} 鹵烷氧基(C_{1-4})伸烷基，但 R^8 、 R^9 及 R^{10} 中之至少一者非為氫； R^{11} 為氫、 C_{1-4} 烷基、苄基(其中該苄基選擇性經以至多3個取代基取代，取代基各自分別係選自鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基以及 C_{1-4} 烷氧基)、甲醯基、 $C(O)C_{1-4}$ 烷基(選擇性經以鹵素或 C_{1-4} 烷氧基取代)、 $C(O)OC_{1-6}$ 烷基(

選擇性經以鹵素、C₁₋₄烷氧基或氰基取代)或C₁₋₄烷氧基(C₁₋₄)伸烷基；R¹²、R¹³、R¹⁴、R¹⁵、R¹⁶及R¹⁷各自分別為氫、鹵素、羥基、C₁₋₆烷基、C₂₋₆烯基[二者選擇性經以鹵素、羥基、C₁₋₄烷氧基、=O、芳基或O-C(O)-C₁₋₄烷基或3-7員羧酸環(其本身選擇性經以至多3個甲基取代)取代]、3-7員飽和環(選擇性經以以至多3個甲基取代，選擇性含有一個選自氮及氧之雜原子)或C₁₋₄烷氧基；或R¹²及R¹³與其附接之碳原子共同形成C=O基團或3-5員碳環系環(選擇性經以至多3個甲基取代，且選擇性經含有至多2個各自分別選自O及N之雜原子)；或R¹²及R¹³共同形成一個C₁₋₆亞烷基(選擇性經以至多3個甲基取代)或一個C₃₋₆亞環烷基(選擇性經以至多3個甲基取代)；R¹⁸、R¹⁹及R²⁰各自分別為氫、鹵素、C₁₋₄烷基、C₁₋₄鹵烷基或C₁₋₄烷氧基(C₁₋₄)伸烷基；以及R²¹為氫、C₁₋₆烷基、C₁₋₆鹵烷基、C₁₋₄烷氧基(C₁₋₄)伸烷基、C₁₋₄烷基-S-(C₁₋₄)伸烷基、C₁₋₄烷氧基或芳基。

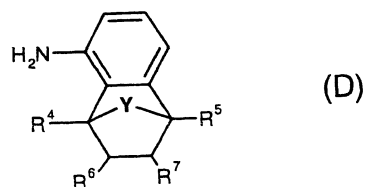
2. 如申請專利範圍第1項之式(I)化合物，此處Het為吡咯基、吡唑基、噻唑基、呋唑基、吡啶基、嘧吡基、嗒吡基、2,3-二氫-[1,4]氧硫雜啉(oxathiine)-6-基、呋吡基、噻吡基或三吡基。
3. 如申請專利範圍第1或2項之式(I)化合物，其中Y為O、N(R¹¹)或(CR¹²R¹³)(CR¹⁴R¹⁵)_m(CR¹⁶R¹⁷)_n。
4. 如申請專利範圍第1項之式(I)化合物，其中R¹為氫、CH₂C≡CR¹⁸、CH=C=CH₂或COR²¹。

5. 如申請專利範圍第1項之式(I)化合物，其中 R^2 為氫、鹵素或 C_{1-4} 烷基。
6. 如申請專利範圍第1項之式(I)化合物，其中 R^3 為氫或甲基。
7. 一種式(C)化合物：



此處Y為O或S；以及 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 各自為 $C(O)OCH_3$ ；或Y為 $N(R^{11})$ 或 $(CR^{12}R^{13})(CR^{14}R^{15})_m(CR^{16}R^{17})_n$ ； R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、m及n各自定義如申請專利範圍第1項之式(I)化合物； R^{11} 為苄基(其中苯基選擇性經以至多3個取代基取代，取代基各自分別係選自鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基及 C_{1-4} 烷氧基)；以及 R^{12} 及 R^{13} 與連同其附接之碳原子共同形成一個3-5員碳環系環(選擇性經以至多3個甲基取代，其含有1或2個各自分別選自O及N之雜原子)。

8. 一種式(D)化合物：



此處Y為O或S；以及 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 各自為 $C(O)OCH_3$ ；或Y為 $N(R^{11})$ 或 $(CR^{12}R^{13})(CR^{14}R^{15})_m(CR^{16}R^{17})_n$ ； R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、m及n各自定義如申請專利

範圍第1項之式(I)化合物； R^{11} 為苄基(其中苯基選擇性經以至多3個取代基取代，取代基各自分別係選自鹵素、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基及 C_{1-4} 烷氧基)；以及 R^{12} 及 R^{13} 與連同其附接之碳原子共同形成一個3-5員碳環系環(選擇性經以至多3個甲基取代，其含有1或2個各自分別選自O及N之雜原子)。

9. 一種控制微生物以及預防微生物攻擊及侵擾植物之組合物，其中該活性成分為如申請專利範圍第1項之式(I)化合物連同適當載劑。
10. 一種控制或預防栽種植物受植物病原性微生物侵擾之方法，該方法係經由施用如申請專利範圍第1項之式(I)化合物至植物、至植物部分或至植物所在位置。

柒、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第()圖。

(二)本代表圖之元件代表符號簡單說明：

捌、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

