

發明專利說明書

(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： 96147369

※ 申請日期： 96.12.12

※IPC 分類：

一、發明名稱：(中文/英文)

新穎的除草劑

NOVEL HERBICIDES

A01N 43/6 (2006.01,

A01N 43/40 (2006.01,

C07D 309/0 (2006.01,

C07D 417/0 (2006.01,

C07D 407/02 (2006.01,

C07D 405/10 (2006.01,

A01P 13/00 (2006.01,

二、申請人：(共 2 人)**姓名或名稱：**(中文/英文)

1. 先正達合夥公司 / SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

2. 先正達有限公司 / SYNGENTA LIMITED

代表人：(中文/英文)

1. (1) 喬瑟琳 塞若尼 / CERONI, JOCELYNE

(2) 寇尼里亞 史基勒 / SCHILLER, CORNELIA

2. 喬瑟琳 塞若尼 / CERONI, JOCELYNE

住居所或營業所地址：(中文/英文)

1. 瑞士，4058 巴賽爾城，黑森林大道 215 號

Schwarzwaldallee 215, 4058 Basel, Switzerland

2. 英國沙伊郡 GU2 7YH 古得佛沙伊研究園區普利斯特里路先正達歐洲區中心

European Regional Centre, Priestly Road, Surrey Research Park,
Guildford, Surrey GU2 7YH, Great Britain**國 籍：**(中文/英文)

1. 瑞士 / Switzerland

2. 英國 / Great Britain

三、發明人：(共 4 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 米歇爾 慕勒巴哈 / MUEHLEBACH, MICHEL
2. 克里斯多夫 約翰 馬修斯 / MATHEWS, CHRISTOPHER JOHN
3. 詹姆斯 尼可拉斯 史考特 / SCUTT, JAMES NICHOLAS
4. 曼加拉 古文卡爾 / GOVENKAR, MANGALA

國 籍：(中文/英文)

1. 瑞士 / Switzerland
2. 英國 / UK
3. 英國 / UK
4. 印度 / India

四、聲明事項：

☐ 主張專利法第二十二條第二項 ☐ 第一款或 ☐ 第二款規定之事實，
其事實發生日期為： 年 月 日。

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1. 英國專利 、 2006.12.14 、 0624961.9
2. 英國專利 、 2007.03.15 、 0705044.6

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

五、中文發明摘要：

本發明關於吡喃二酮、硫代吡喃二酮及環己三酮化合物，彼等適合用作除草劑。

六、英文發明摘要：

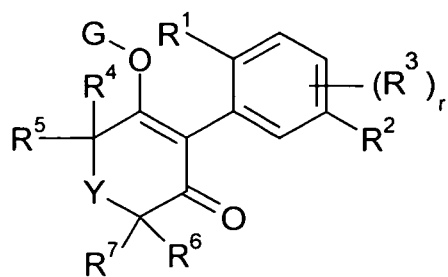
Pyrandione, thiopyrandione and cyclohexanetrione compounds, which are suitable for use as herbicides.

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第 (無) 圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

無

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

(I),

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明關於新穎的除草活性環狀二酮類及其衍生物，彼等之製備方法，含有該等化合物的組成物及彼等在控制雜草，尤其在有用植物的農作物中的雜草，或抑制植物生長中的用途。

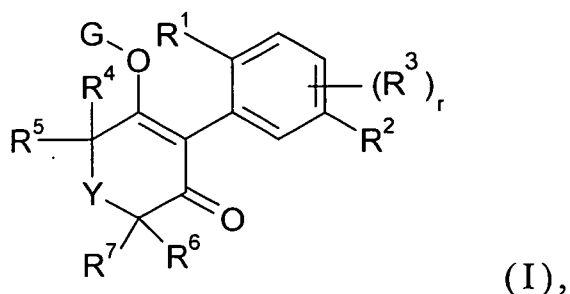
【先前技術】

具有除草作用的環狀二酮類被敘述在例如 WO 01/74770 中。

【發明內容】

現在頃發現具有除草及生長抑制性質之新穎的吡喃二酮、硫代吡喃二酮及環己三酮化合物。

本發明因此關於式 I 化合物：



其中

R¹ 為鹵素、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 鹵烷基、C₃-C₆ 環烷基、C₂-C₄ 烯基、C₂-C₄ 鹵烯基、C₂-C₄ 炔基、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、硝基或氰基；

R^2 為視需要取代之芳基或視需要取代之雜芳基；

r 為 0、1、2 或 3；

如果 r 為 1，則 R^3 為鹵素、 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、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_6 烷基磺醯基、氰基或硝基；或如果 r 為 2 或 3，則取代基 R^3 彼此獨立為鹵素、 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、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_6 烷基磺醯基、氰基或硝基；

R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 彼此獨立為氫、 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、 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 烷基；環丙基或被 C_1 -或 C_2 烷基、 C_1 -或 C_2 鹵烷基或鹵素取代之環丙基；環丁基或被 C_1 -或 C_2 烷基取代之環丁基；氧環丁基或被 C_1 -或 C_2 烷基取代之氧環丁基； C_5 - C_7 環烷基或被 C_1 -或 C_2 烷基或 C_1 -或 C_2 鹵烷基取代之 C_5 - C_7 環烷基，其中環烷基部分的亞甲基視需要被氧或硫原子或亞磺醯基或磺醯基代替； C_4 - C_7 環烯基或被 C_1 -或 C_2 烷基或 C_1 -或 C_2 鹵烷基取代之 C_4 - C_7 環烯基，其中環烯基部分的亞甲基視需要被氧或硫原子或亞磺醯基或磺醯基代替；環丙基 C_1 - C_5 烷基或被 C_1 -或 C_2 烷基、 C_1 -或 C_2 鹵烷基或鹵素取代之環丙基 C_1 - C_5 烷基；環丁基 C_1 - C_5 烷基或被 C_1 - C_2 烷基取代之環丁基 C_1 - C_5 烷基；氧環丁基 C_1 - C_5 烷基或被 C_1 -或 C_2 烷基取代之氧環丁基 C_1 - C_5 烷基； C_5 - C_7 環烷基 C_1 - C_5 烷基或被

C_1 -或 C_2 烷基或 C_1 -或 C_2 鹵烷基取代之 C_5 - C_7 環烷基 C_1 - C_5 烷基，其中環烷基部分的亞甲基視需要被氧或硫原子或亞磺醯基或磺醯基代替； C_4 - C_7 環烯基 C_1 - C_5 烷基或被 C_1 -或 C_2 烷基或 C_1 -或 C_2 鹵烷基取代之 C_4 - C_7 環烯基 C_1 - C_5 烷基，其中環烯基部分的亞甲基視需要被氧或硫原子或亞磺醯基或磺醯基代替；苯基或被 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷基、鹵素、硝基、氰基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯基或 C_1 - C_4 烷羰基取代之苯基；苯甲基或被 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷基、鹵素、硝基、氰基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯基或 C_1 - C_4 烷羰基取代之苯甲基；雜芳基或被 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷基、鹵素、硝基、氰基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯基或 C_1 - C_4 烷羰基取代之雜芳基；或

R^4 與 R^5 ，或 R^6 與 R^7 連結形成 5-7 員飽和或不飽和環，其中亞甲基視需要被氧原子或硫原子代替；或被 C_1 -或 C_2 烷基取代之 5-7 員飽和或不飽和環，其中環的亞甲基視需要被氧原子或硫原子代替；或

R^4 與 R^7 連結形成 5-7 員飽和或不飽和環，其未被取代或被 C_1 -或 C_2 烷基、 C_1 -或 C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 烷氧基 C_1 - C_2 烷基、羥基、鹵素；苯基或被 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷基、鹵素、硝基、氰基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯基或 C_1 - C_4 烷羰基取代之苯基；雜芳基或被 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷基、鹵素、

硝基、氰基、 C_1-C_4 烷基硫基、 C_1-C_4 烷基亞磺基、 C_1-C_4 烷基磺基或 C_1-C_4 烷基羰基取代之雜芳基取代；

Y 為 O、C=O、 $S(O)_m$ 或 $S(O)_nNR^8$ ，其先決條件係當 Y 為 C=O 時，當 R^4 或 R^5 中任一者為氫時，則 R^6 及 R^7 不同於氫，當 R^6 或 R^7 中任一者為氫時，則 R^4 及 R^5 不同於氫；

m 為 0 或 1 或 2 及 n 為 0 或 1；

R^8 為氫、 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 環烷基、 C_1-C_6 烷氧基羰基、三(C_1-C_6 烷基)矽烷基乙氧基羰基、 C_1-C_6 鹵烷氧基羰基、氰基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_1-C_6 羥烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_1-C_6 烷羰基、 C_1-C_6 鹵烷羰基、 C_1-C_6 環烷基羰基、苯羰基或被 R^9 取代之苯羰基；苯甲羰基或被 R^9 取代之苯甲羰基；吡啶羰基或被 R^9 取代之吡啶羰基；苯氧羰基或被 R^9 取代之苯氧羰基；苯甲氧基羰基或被 R^9 取代之苯甲氧基羰基；

R^9 為 C_1-C_6 鹵烷基、 C_1-C_6 烷氧基羰基、硝基、氰基、甲醯基、羧基或鹵素；及

G 為氫、農業上可接受之陽離子或潛伏化基團 (latent group)。

在式 I 化合物的取代基定義中，具有 1 至 6 個碳原子之烷基取代基及烷氧基、烷硫基等的烷基部分較佳地為具有彼之直鏈及支鏈異構物的形式之甲基、乙基、丙基、丁基、戊基及己基。多至 10 個碳原子之高碳烷基較佳地包含具有彼之直鏈及支鏈異構物的形式之辛基、壬基及癸基。具有 2 至 6 個碳原子與多至 10 個碳原子之烯基及炔

基可為直鏈或支鏈，並可包括超過 1 個以上的雙鍵或參鍵。實例為乙烯基、烯丙基、丙炔基、丁烯基、丁炔基、戊烯基及戊炔基。適合的環烷基包括 3 至 7 個碳原子且為例如環丙基、環丁基、環戊基、環己基及環庚基。以環丙基、環丁基、環戊基及環己基較佳。較佳的鹵素為氟、氯及溴。芳基的較佳實例為苯基及萘基。雜芳基的較佳實例為噻吩基、呋喃基、吡咯基、異噁唑基、噁唑基、異噻唑基、噻唑基、吡唑基、咪唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、三嗪基、噁二唑基、噻二唑基及噻吩基，及在適當時，彼之 N-氧化物及鹽類。這些芳基及雜芳基可被一或多個取代基取代，其中較佳的取代基為鹵素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 鹵烯基、 C_2 - C_4 炔基、 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 烷基亞磺基、 C_1 - C_4 烷基磺基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺基、 C_1 - C_4 鹵烷基磺基、硝基或氰基。基團 G 代表氫、農業上可接受之陽離子（如鹼金屬陽離子、鹼土金屬陽離子、銻陽離子（較佳地為三(C_1 - C_6)烷基銻陽離子）、銨陽離子、 C_1 - C_6 烷基銨陽離子、二(C_1 - C_6 烷基)銨陽離子、三(C_1 - C_6)烷基銨陽離子或四(C_1 - C_6)烷基銨陽離子）或潛伏化基團。這些潛伏化基團 G 的選擇允許其在施予處理之區域或植物之前、期間或之後以一種或組合的生化、化學或物理法移除，以供給其中 G 為 H 之式 I 化合物。這些方法的實例包括酵素裂解法、化學水解法及光分解法。攜帶該等潛伏化基團 G 的化合物可提供某些優點，如

被處理之植物經改進之角質層穿透；增加之農作物耐受性；在含有其他除草劑、除草劑安全劑 (safener)、植物生長調節劑、殺真菌劑或殺昆蟲劑之調配混合物中經改進之相容性或穩定性；或減少在土壤中被濾掉。潛伏化基團 G 較佳地選自基團 G，其為 C_1-C_8 烷基、 C_2-C_8 鹵烷基、苯基 C_1-C_8 烷基（其中苯基可視需要被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺醯基、 C_1-C_3 烷基磺醯基、鹵素、氰基或硝基取代）、雜芳基 C_1-C_8 烷基（其中雜芳基可視需要被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺醯基、 C_1-C_3 烷基磺醯基、鹵素、氰基或硝基取代）、 C_3-C_8 烯基、 C_3-C_8 鹵烯基、 C_3-C_8 炔基、 $C(X^a)-R^a$ 、 $C(X^b)-X^c-R^b$ 、 $C(X^d)-N(R^c)-R^d$ 、 $-SO_2-R^e$ 、 $-P(X^e)(R^f)-R^g$ 或 $CH_2-X^f-R^h$ ，其中 X^a 、 X^b 、 X^c 、 X^d 、 X^e 及 X^f 彼此獨立為鹵素或硫；

R^a 為 H、 C_1-C_{18} 烷基、 C_2-C_{18} 烯基、 C_2-C_{18} 炔基、 C_1-C_{10} 鹵烷基、 C_1-C_{10} 氰烷基、 C_1-C_{10} 硝烷基、 C_1-C_{10} 胺烷基、 C_1-C_5 烷胺基 C_1-C_5 烷基、二(C_2-C_8 烷基)胺基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_7 環烷基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷氧基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_5 烯氧基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_5 炔氧基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷硫基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基亞磺醯基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基磺醯基 C_1-C_5 烷基、 C_2-C_8 亞烷基胺氧基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷羰基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷氧基羰基 C_1-C_5 烷基、胺羰基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷胺基羰基 C_1-C_5 烷基、二(C_2-C_8 烷基)胺羰基

C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷羰基胺基 C_1-C_5 烷基、 $N-C_1-C_5$ 烷羰基
 $-N-C_1-C_5$ 烷胺基 C_1-C_5 烷基、三(C_3-C_6 烷基)矽烷基 C_1-C_5
 烷基、苯基 C_1-C_5 烷基 (其中苯基可視需要被 C_1-C_3 烷基、
 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫
 基、 C_1-C_3 烷基亞磺醯基、 C_1-C_3 烷基磺醯基、鹵素、氰基
 或硝基取代)、雜芳基 C_1-C_5 烷基 (其中雜芳基可視需要
 被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧
 基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺醯基、 C_1-C_3 烷基磺醯
 基、鹵素、氰基或硝基取代)、 C_2-C_5 鹵烯基、 C_3-C_8 環烷
 基、苯基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3
 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之苯基、雜芳基或被 C_1-C_3
 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵
 素、氰基或硝基取代之雜芳基；

R^b 為 C_1-C_{18} 烷基、 C_3-C_{18} 烯基、 C_3-C_{18} 炔基、 C_2-C_{10} 鹵烷
 基、 C_1-C_{10} 氰烷基、 C_1-C_{10} 硝烷基、 C_2-C_{10} 胺烷基、 C_1-C_5
 烷胺基 C_1-C_5 烷基、二(C_2-C_8 烷基)胺基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_7
 環烷基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷氧基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_5 烯氧
 基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_5 炔氧基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷硫基 C_1-
 C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基亞磺醯基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基磺醯
 基 C_1-C_5 烷基、 C_2-C_8 亞烷基胺氧基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷
 羰基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷氧基羰基 C_1-C_5 烷基、胺羰基 C_1-C_5
 烷基、 C_1-C_5 烷胺基羰基 C_1-C_5 烷基、二(C_2-C_8 烷基)胺羰基
 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷羰基胺基 C_1-C_5 烷基、 $N-C_1-C_5$ 烷羰基
 $-N-C_1-C_5$ 烷胺基 C_1-C_5 烷基、三(C_3-C_6 烷基)矽烷基 C_1-C_5

烷基、苯基 C_1-C_5 烷基（其中苯基可視需要被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺醯基、 C_1-C_3 烷基磺醯基、鹵素、氰基或硝基取代）、雜芳基 C_1-C_5 烷基（其中雜芳基可視需要被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺醯基、 C_1-C_3 烷基磺醯基、鹵素、氰基或硝基取代）、 C_2-C_5 鹵烯基、 C_3-C_8 環烷基、苯基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之苯基、雜芳基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之雜芳基，

R^c 及 R^d 彼此獨立為氫、 C_1-C_{10} 烷基、 C_3-C_{10} 烯基、 C_3-C_{10} 炔基、 C_2-C_{10} 鹵烷基、 C_1-C_{10} 氰烷基、 C_1-C_{10} 硝烷基、 C_1-C_{10} 胺烷基、 C_1-C_5 烷胺基 C_1-C_5 烷基、二(C_2-C_8 烷基)胺基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_7 環烷基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷氧基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_5 烯氧基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_5 炔氧基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷硫基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基亞磺醯基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基磺醯基 C_1-C_5 烷基、 C_2-C_8 亞烷基胺氧基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷羰基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷氧基羰基 C_1-C_5 烷基、胺羰基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷胺基羰基 C_1-C_5 烷基、二(C_2-C_8 烷基)胺羰基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷羰基胺基 C_1-C_5 烷基、 $N-C_1-C_5$ 烷羰基 $-N-C_2-C_5$ 烷胺基烷基、 C_3-C_6 三烷基矽烷基 C_1-C_5 烷基、苯基 C_1-C_5 烷基（其中苯基可視需要被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基

基、 C_1-C_3 烷基硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺基、 C_1-C_3 烷基磺基、鹵素、氰基或硝基取代)、雜芳基 C_1-C_5 烷基(其中雜芳基可視需要被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷基硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺基、 C_1-C_3 烷基磺基、鹵素、氰基或硝基取代)、 C_2-C_5 鹵烯基、 C_3-C_8 環烷基、苯基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之苯基、雜芳基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之雜芳基、雜芳基胺基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之雜芳基胺基、二雜芳基胺基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之二雜芳基胺基、苯胺基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之苯胺基、二苯胺基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之二苯胺基、胺基、 C_1-C_3 烷基胺基、二(C_1-C_3 烷基)胺基、 C_1-C_3 烷氧基或 C_3-C_7 環烷基胺基、二(C_3-C_7 環烷基)胺基或 C_3-C_7 環烷氧基，或 R^e 與 R^d 可連結在一起形成 3-7 員環，視需要包括一個選自 O 或 S 之雜原子及視需要被 1 或 2 個 C_1-C_3 烷基取代；

R^e 為 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_1-C_{10} 鹵烷基、 C_1-C_{10} 氰烷基、 C_1-C_{10} 硝烷基、 C_1-C_{10} 胺烷基、 C_1-C_5 烷基胺基、 C_1-C_5 烷基、二(C_2-C_8 烷基)胺基、 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_7

環烷基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷氧基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_5 烯氧基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_5 炔氧基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷硫基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基亞磺醯基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基磺醯基 C_1-C_5 烷基、 C_2-C_8 亞烷基胺氧基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷羰基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷氧基羰基 C_1-C_5 烷基、胺羰基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷胺基羰基 C_1-C_5 烷基、二(C_2-C_8 烷基)胺羰基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷羰基胺基 C_1-C_5 烷基、N- C_1-C_5 烷羰基-N- C_1-C_5 烷胺基 C_1-C_5 烷基、三(C_3-C_6 烷基)矽烷基 C_1-C_5 烷基、苯基 C_1-C_5 烷基 (其中苯基可視需要被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺醯基、 C_1-C_3 烷基磺醯基、鹵素、氰基或硝基取代)、雜芳基 C_1-C_5 烷基 (其中雜芳基可視需要被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺醯基、 C_1-C_3 烷基磺醯基、鹵素、氰基或硝基取代)、 C_2-C_5 鹵烯基、 C_3-C_8 環烷基、苯基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之苯基、雜芳基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之雜芳基、雜芳基胺基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之二雜芳基胺基、苯胺基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵

素、氰基或硝基取代之苯胺基、胺基、二苯胺基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之二苯胺基；或 C_3-C_7 環烷胺基、二(C_3-C_7 環烷基)胺基或 C_3-C_7 環烷氧基、 C_1-C_{10} 烷氧基、 C_1-C_{10} 鹵烷氧基、 C_1-C_5 烷胺基或二(C_2-C_8 烷基)胺基，

R^f 及 R^g 彼此獨立為 C_1-C_{10} 烷基、 C_2-C_{10} 烯基、 C_2-C_{10} 炔基、 C_1-C_{10} 烷氧基、 C_1-C_{10} 鹵烷基、 C_1-C_{10} 氰烷基、 C_1-C_{10} 硝烷基、 C_1-C_{10} 胺烷基、 C_1-C_5 烷胺基 C_1-C_5 烷基、二(C_2-C_8 烷基)胺基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_7 環烷基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷氧基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_5 烯氧基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_5 炔氧基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷硫基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基亞磺醯基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基磺醯基 C_1-C_5 烷基、 C_2-C_8 亞烷基胺氧基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷羰基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷氧基羰基 C_1-C_5 烷基、胺羰基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷胺基羰基 C_1-C_5 烷基、二(C_2-C_8 烷基)胺羰基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷羰基胺基 C_1-C_5 烷基、 $N-C_1-C_5$ 烷羰基- $N-C_2-C_5$ 烷胺基烷基、三(C_3-C_6 烷基)矽烷基 C_1-C_5 烷基、苯基 C_1-C_5 烷基（其中苯基可視需要被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺醯基、 C_1-C_3 烷基磺醯基、鹵素、氰基或硝基取代）、雜芳基 C_1-C_5 烷基（其中雜芳基可視需要被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺醯基、 C_1-C_3 烷基磺醯基、鹵素、氰基或硝基取代）、 C_2-C_5 鹵烯基、 C_3-C_8 環烷基、苯基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3

烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之苯基、雜芳基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之雜芳基、雜芳基胺基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之雜芳基胺基、二雜芳基胺基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之二雜芳基胺基、苯胺基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之苯胺基、胺基、羥基、二苯胺基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之二苯胺基、或 C_3-C_7 環烷胺基、二(C_3-C_7 環烷基)胺基或 C_3-C_7 環烷氧基、 C_1-C_{10} 鹵烷氧基、 C_1-C_5 烷胺基或二(C_2-C_5 烷基)胺基、苯甲氧基或苯氧基，其中苯甲基及苯基可依次被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代，及

R^h 為 C_1-C_{10} 烷基、 C_3-C_{10} 烯基、 C_3-C_{10} 炔基、 C_1-C_{10} 鹵烷基、 C_1-C_{10} 氰烷基、 C_1-C_{10} 硝烷基、 C_2-C_{10} 胺烷基、 C_1-C_5 烷胺基 C_1-C_5 烷基、二(C_2-C_8 烷基)胺基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_7 環烷基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷氧基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_5 烯氧基 C_1-C_5 烷基、 C_3-C_5 炔氧基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷硫基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基亞磺基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷基磺基 C_1-C_5 烷基、 C_2-C_8 亞烷基胺氧基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷羰基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷氧基羰基 C_1-C_5 烷基、胺羰基 C_1-C_5

烷基、 C_1-C_5 烷胺基羰基 C_1-C_5 烷基、二(C_2-C_8 烷基)胺羰基 C_1-C_5 烷基、 C_1-C_5 烷羰基胺基 C_1-C_5 烷基、 $N-C_1-C_5$ 烷羰基- $N-C_1-C_5$ 烷胺基 C_1-C_5 烷基、三(C_3-C_6 烷基)矽烷基 C_1-C_5 烷基、苯基 C_1-C_5 烷基(其中苯基可視需要被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺醯基、 C_1-C_3 烷基磺醯基、鹵素、氰基或硝基取代)、雜芳基 C_1-C_5 烷基(其中雜芳基可視需要被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺醯基、 C_1-C_3 烷基磺醯基、鹵素、氰基或硝基取代)、苯氧基 C_1-C_5 烷基(其中苯基可視需要被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺醯基、 C_1-C_3 烷基磺醯基、鹵素、氰基或硝基取代)、雜芳氧基 C_1-C_5 烷基(其中雜芳基可視需要被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺醯基、 C_1-C_3 烷基磺醯基、鹵素、氰基或硝基取代之苯基、雜芳基或被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、鹵素、氰基或硝基取代之雜芳基。

在式 I 化合物較佳的基團中， R^1 為鹵素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 烯基或 C_2-C_4 炔基。

在式 I 化合物另一較佳的基團中， R^2 為芳基或雜芳基；或被鹵素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4

鹵烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、苯
 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_3-C_6 環烷基、 C_1-C_4 烷基磺醯氧基、 C_1-C_4
 鹵烷基磺醯氧基、 C_1-C_4 烷氧基 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷硫基
 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷基亞磺醯基 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷基磺
 醯基 C_1-C_4 烷基、硝基、氰基、硫氰基、羥基、胺基、 C_1-
 C_6 烷胺基、 C_1-C_6 二烷胺基、 C_3-C_6 環烷胺基、嗎福林基、
 硫代嗎福林基、 C_1-C_6 烷羰基胺基、 C_1-C_4 烷氧基羰胺基、
 C_3-C_6 烯氧基羰胺基、 C_3-C_6 炔氧基羰胺基、 C_1-C_6 烷胺基
 羰胺基、二(C_{1-6} 烷基)胺羰基胺基、甲醯基、 C_1-C_6 烷羰基、
 C_2-C_6 烯羰基、 C_2-C_6 炔羰基、羧基、 C_1-C_6 烷氧基羰基、 C_3-C_6
 烯氧基羰基、 C_3-C_6 炔氧基羰基、甲醯胺基、 C_1-C_6 烷胺基
 羰基、二(C_1-C_6 烷基)胺羰基、 C_1-C_6 烷羰氧基、 C_1-C_6 烷胺
 基羰氧基、二(C_1-C_6 烷基)胺羰氧基或 C_1-C_6 烷硫基羰胺基
 取代的芳基或雜芳基二者。

較佳地，在式 I 化合物中的 R^2 為芳基或雜芳基；或被
 鹵素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、苯氧基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4
 鹵烯基、 C_2-C_4 炔基、 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、
 硝基或氰基取代的芳基或雜芳基二者。

更佳地， R^2 為苯基、噻吩基、呋喃基、吡咯基、異噁
 唑基、噁唑基、異噻唑基、噻唑基、吡唑基、咪唑基、三

唑基、四唑基、吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、三吡嗪基、嗒嗪基、噁二唑基及噻二唑基，及其 N-氧化物與鹽類，其中這些環未被取代或被鹵素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 鹵烯基、 C_2-C_4 炔基、 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、硝基或氰基取代。

在甚至更佳的式 I 化合物中， R^2 為苯基或吡啶基，或被鹵素、硝基、氰基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基或 C_1-C_2 鹵烷氧基取代之苯基或吡啶基二者。

在化合物尤其佳的基團中， R^2 為在對位置上被鹵素（特別為氯）取代之苯基，且視需要被鹵素、硝基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基或 C_1-C_2 鹵烷氧基進一步取代。

較佳地， R^3 為氫（ r 為 0）、鹵素或 C_1-C_6 烷基，尤其為氫。

較佳地，如果 r 為 1，則 R^3 為鹵素或 C_1-C_3 烷基。

較佳的是其中 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 彼此獨立為氫、 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、 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 烷基磺醯基、 C_1-C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 鹵烷基磺醯基、 C_5-C_7 環烷基或被 C_1 -或 C_2 烷基或 C_1 -或 C_2 鹵烷基取代之 C_5-C_7 環烷基，且其中環烷基部分的亞甲基視需要被氧或硫原子或亞磺醯基或磺醯基代替； C_5-C_7 環烷基、 C_1-C_5 烷基或被 C_1-C_2 烷基或 C_1 -或 C_2 鹵烷基取代。

之 C_5-C_7 環烷基 C_1-C_5 烷基，其中環烷基部分的亞甲基視需要被氧或硫原子或亞磺醯基或磺醯基代替的那些式 I 化合物。

更佳地， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 彼此獨立為氫、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基或 C_1-C_2 烷氧基 C_1-C_2 烷基。

Y 的較佳意義為 O、C=O 及 S。

尤其較佳的 Y 為 O。

較佳地，G 代表 $C(X^a)-R^a$ 或 $C(X^b)-X^c-R^b$ ，而 X^a 、 R^a 、 X^b 、 X^c 及 R^b 之意義係如上述所定義。甚至更佳地，潛伏化基團 G 係選自基團 $C(X^a)-R^a$ 、 $C(X^b)-X^c-R^b$ ，其中 X^a 、 X^b 及 X^c 為氧， R^a 為 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基或 C_1-C_4 烷氧基 C_1-C_4 烷基及 R^b 為 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基或 C_1-C_4 烷氧基 C_1-C_4 烷基。

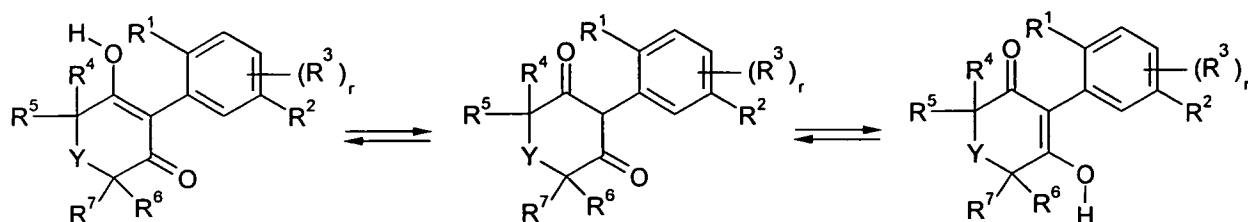
更重要的基團 G 代表氫、鹼金屬或鹼土金屬陽離子作為農業上可接受之陽離子，其中氫特別佳。

在 (I) 化合物較佳的基團中， R^1 為 C_1-C_4 烷基， R^2 為苯基或被鹵素或 C_1-C_2 烷基取代之苯基， R^3 為氫， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 彼此獨立為 C_1-C_2 烷基，Y 為 O 及 G 為氫。

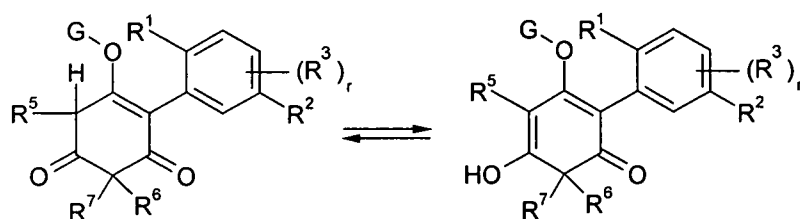
本發明也關於式 I 化合物能夠與胺、鹼金屬和鹼土金屬鹼或四級銨鹼形成的鹽類。

在作為鹽形成劑的鹼金屬和鹼土金屬氫氧化物之中，尤其應該說明鋰、鈉、鉀、鎂及鈣的氫氧化物，但是尤其為鈉及鉀的氫氧化物。根據本發明的式 I 化合物也包括可

依據取代基 G 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 及 R^8 的本性而定，式 I 化合物可以不同的異構物形式存在。例如當 G 為氫時，則式 I 化合物可以不同的互變異構物形式存在：



此外，當 Y 為 $C=O$ 及 R^4 為氫時，則更多的式 I 化合物可以不同的互變異構物形式存在：

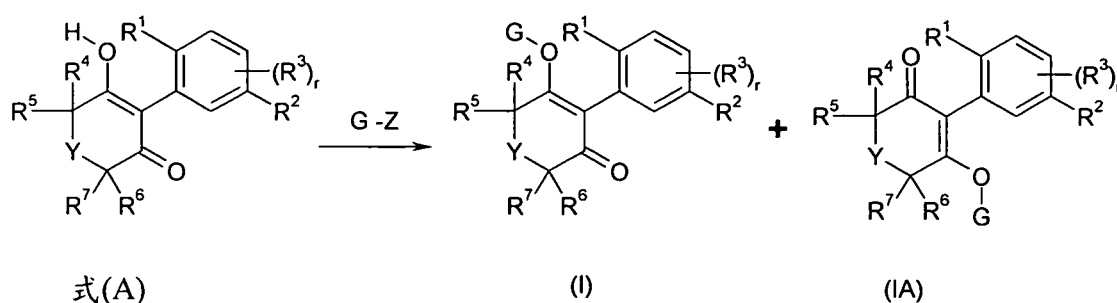


而且，當取代基也包括雙鍵時，則順式-及反式-異構物可能存在。本發明涵蓋以所有比例的所有該等異構物與互變異構物及其混合物。這些異構物也在所申請之式 I 化合物的範圍內。

其中 G 為 C_1 - C_8 烷基、 C_2 - C_8 鹵烷基、苯基 C_1 - C_8 烷基（其中苯基可視需要被 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 鹵烷氧基、 C_1 - C_3 烷硫基、 C_1 - C_3 烷基亞磺基、 C_1 - C_3 烷基磺基、鹵素、氰基或硝基取代）、雜

芳基 C_1-C_8 烷基 (其中雜芳基可視需要被 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 烷基亞磺基、 C_1-C_3 烷基磺基、鹵素、氰基或硝基取代)、 C_3-C_8 烯基、 C_3-C_8 鹵烯基、 C_3-C_8 炔基、 $C(X^a)-R^a$ 、 $C(X^b)-X^c-R^b$ 、 $C(X^d)-N(R^c)-R^d$ 、 $-SO_2-R^e$ 、 $-P(X^e)(R^f)-R^g$ 或 $CH_2-X^f-R^h$ ，其中 X^a 、 X^b 、 X^c 、 X^d 、 X^e 、 X^f 、 R^a 、 R^b 、 R^c 、 R^d 、 R^e 、 R^f 、 R^g 及 R^h 如上述所定義之式(I)化合物可藉由將式(A)化合物，其為其中 G 為 H 之式(I)化合物，以試劑 G-Z，其中 G-Z 為烷基化劑，如烷基鹵 (烷基鹵的定義包括簡單的 C_1-C_8 烷基鹵，如甲基碘及乙基碘；經取代之烷基鹵，如其中 X^f 為氧之氯甲基烷基醚 $Cl-CH_2-X^f-R^h$ ，及其中 X^f 為硫之氯甲基烷基硫 $Cl-CH_2-X^f-R^h$)、磺酸 C_1-C_8 烷酯或硫酸二(C_1-C_8 烷基)酯；或以 C_3-C_8 烯基鹵；或以 C_3-C_8 炔基鹵；或以醯化劑，如其中 X^a 為氧之羧酸 $HO-C(X^a)R^a$ ，其中 X^a 為氧之醯基氯 $Cl-C(X^a)R^a$ ，或其中 X^a 為氧之羧酐 $[R^aC(X^a)]_2O$ ，或異氰酸酯 $R^cN=C=O$ ，或胺基甲醯氯 $Cl-C(X^d)-N(R^c)-R^d$ (其中 X^d 為氧，而其先決條件係 R^c 或 R^d 中之一為氫)，或硫代胺基甲醯氯 $Cl-(X^d)-N(R^c)-R^d$ (其中 X^d 為硫，而其先決條件係 R^c 或 R^d 中之一為氫)，或氯基甲酸酯 $Cl-C(X^b)-X^c-R^b$ (其中 X^b 及 X^c 為氧)，或氯基硫代甲酸酯 $Cl-C(X^b)-X^c-R^b$ (其中 X^b 為氧及 X^c 為硫)，或氯基二硫代甲酸酯 $Cl-C(X^b)-X^c-R^b$ (其中 X^b 及 X^c 為硫)，或異硫代氰酸酯 $R^cN=C=S$ 處理；或以二硫化碳及烷基化劑；或以磷酸化劑，如磷醯氯 $Cl-P(X^e)(R^f)-R^g$ ；或以磺酸

化劑，如磺醯氯 $\text{Cl-SO}_2\text{-R}^e$ 相繼處理而製備，較佳地該處理係在至少 1 當量鹼的存在下。其中取代基 R^4 及 R^5 不等於取代基 R^6 及 R^7 ，這些反應可生產第二種式(IA)化合物，除了式(I)化合物之外。本發明涵蓋式(I)化合物及式(IA)化合物二者與該等化合物以任何比例之混合物一起。



環狀 1,3-二酮類之 O-烷基化反應為已知的，適合的方法由例如 T. Wheeler 於 US4436666 所敘述。替換步驟由 M. Pizzorno 及 S. Albonico 於 Chem. Ind. (倫敦)，(1972)，425-426；H. Born 等人於 J. Chem. Soc., (1953)，1779-1782；M. G. Constantino 等人於 Synth. Commun., (1992)，22 (19)，2859-2864；Y. Tian 等人於 Synth. Commun., (1997)，27 (9)，1577-1582；S. Chandra Roy 等人於 Chem. Letters, (2006)，35 (1)，16-17；P. K. Zubaidha 等人於 Tetrahedron Lett., (2004)，45，7187-7188 所提出。

環狀 1,3-二酮類之 O-醯化反應可由類似於那些例如由 R. Haines 於 US4175135 及由 T. Wheeler 於 US4422870、US4659372 及 US4436666 所述之步驟而完成。典型地，式(A)之二酮類可以醯化劑在較佳地 1 當量適合的鹼存在下，

及視需要在適合的溶劑存在下處理。該鹼可為無機鹼，如鹼金屬碳酸鹽或氫氧化物，或鹼金屬氫化物，或有機鹼，如三級胺或金屬烷醇化物。適合的無機鹼的實例包括碳酸鈉、氫氧化鈉或鉀、氫化鈉，而適合的有機鹼包括三烷基胺，如三甲胺及三乙胺、吡啶或其他胺鹼類，如 1,4-二氮雜雙環[2.2.2]-辛烷及 1,8-二氮雜雙環[5.4.0]十一-7-烯。較佳的鹼包括三乙胺及吡啶。適合於該反應的溶劑係選自與試劑相容者，並包括醚類，如四氫呋喃及 1,2-二甲氧基乙烷；及鹵化溶劑，如二氯甲烷及氯仿。某些鹼類，如吡啶及三乙胺可成功地被用作鹼及溶劑二者。關於其中醯化劑為羧酸的例子中，醯化反應較佳地在已知的偶合劑，如碘化 2-氯基-1-甲基吡啶、N,N'-二環己基碳化二醯亞胺、1-(3-二甲胺基丙基)-3-乙基碳化二醯亞胺及 N,N'-碳化二醯亞胺的存在下及視需要在鹼，如三乙胺或吡啶的存在下於適合的溶劑中，如四氫呋喃、二氯甲烷或乙腈中完成。適合的步驟由例如 W. Zhang 和 G. Pugh 於 *Tetrahedron Lett.*, (1999), 40 (43), 7595-7598; T. Isobe 和 T. Ishikawa 於 *J. Org. Chem.* (1999), 64 (19), 6984-6988 及 K. Nicolaou 於 T. Montagnon, G. Vassilikogiannakis, C. Mathison 於 *J. Am. Chem. Soc.*, (2005), 127 (24), 8872-8888 所敘述。

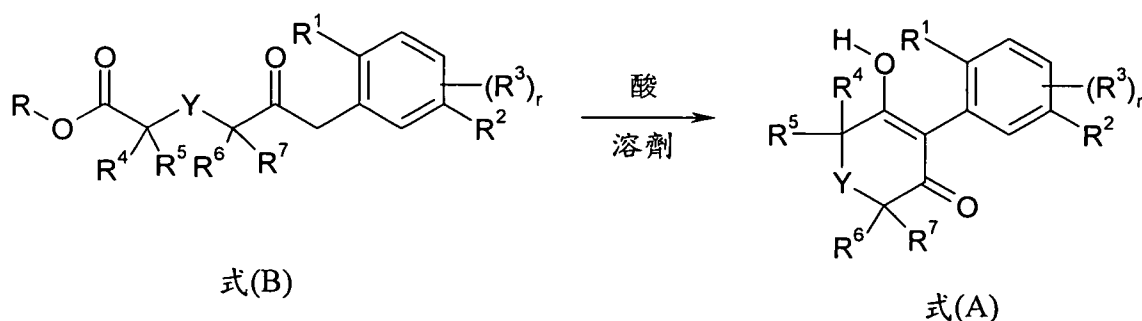
環狀 1,3-二酮類的磷酸化反應可使用磷醯鹵或硫代磷醯鹵及鹼以類似於那些由 L. Hodakowski 於 US4409153 所述之步驟而完成。

式(A)化合物的磺酸化反應可使用烷基或芳基磺醯鹵而

達成，較佳地在至少 1 當量鹼的存在下以例如 C. Kowalski 和 K. Fields 於 J. Org. Chem., (1981), 46, 197-201 之步驟。

其中 Y 為 $S(O)_m$ 及 m 為 1 或 2 之式(A)化合物可從其中 Y 為 S 之式(A)化合物以氧化法而製備，該氧化法係根據類似於 E. Fehnel 和 A. Paul 於 J. Am. Chem. Soc., (1955), 77, 4241-4244 之步驟。

其中 Y 為 O、S 或 C=O 之式(A)化合物可經由式(B)化合物之環化反應而製備，較佳地在酸或鹼的存在下及視需要在適合的溶劑存在下，以類似於那些由 T. Wheeler 於 us4209532 所述之方法。式(B)化合物特別被設計成在式 I 化合物合成中的中間物。其中 R 為氫或 C_1-C_4 烷基（尤其為甲基、乙基及第三丁基）之式(B)化合物可在酸性條件下環化，較佳地在強酸，如硫酸、多磷酸或伊頓（Eaton）氏試劑的存在下，視需要在適合的溶劑，如乙酸、甲苯或二氯甲烷的存在下。

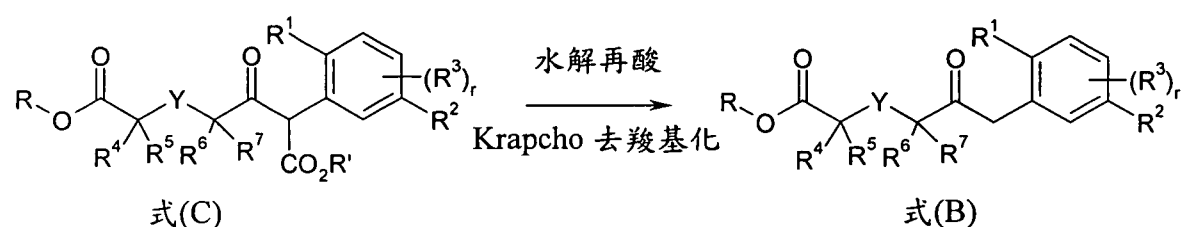


其中 R 為烷基（較佳地為甲基或乙基）之式(B)化合物可在酸性或鹼性條件下，較佳地在鹼性條件下在至少 1 當

量強鹼，如第三丁醇鉀、二異丙基醯胺鋰、雙(三甲基矽烷基)醯胺鈉或氫化鈉的存在下及在溶劑中，如四氫呋喃、甲苯、二甲基亞砷或 N,N-二甲基甲醯胺中環化。

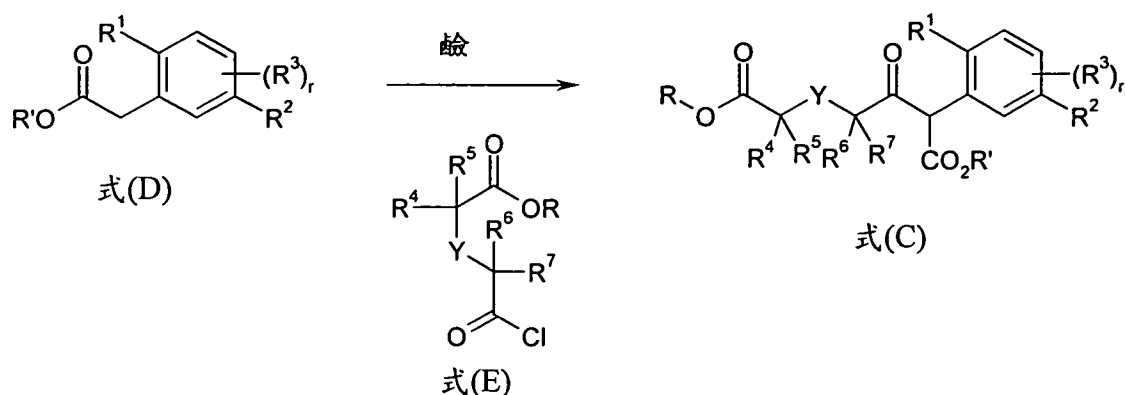
其中 R 為 H 之式(B)化合物可在已知的條件下(例如，以醇、R-OH 在酸催化劑的存在下處理)酯化成其中 R 為烷基之式(B)化合物。

其中 R 為 H 之式(B)化合物可藉由水解其中 R 為 H 或烷基及 R' 為烷基(較佳地為甲基或乙基)之式(C)化合物，接著藉由類似於那些由例如 T. Wheeler 於 US4209532 所述之方法酸化反應混合物，以完成去羧基化反應而製備。或者，其中 R 為烷基(較佳地為甲基)之式(B)化合物可從其中 R 為烷基(較佳地為甲基)之式(C)化合物經由在使用已知試劑的已知條件下的 Krapcho 去羧基化步驟而製備(參見例如 G. Quallich, P. Morrissey 於 Synthesis, (1993), (1), 51-53)。

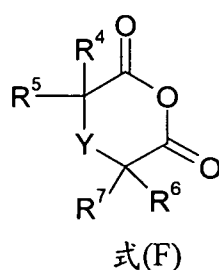


其中 R 為烷基之式(C)化合物可藉由將式(D)化合物在鹼性條件下以其中 R 為烷基之適合的式(E)之羧酸氯處理而製備。適合的鹼包括第三丁醇鉀、雙(三甲基矽烷基)醯胺鈉及二異丙基醯胺鋰，而且反應較佳地在適合的溶劑中(如

四氫呋喃或甲苯) 以介於 -80°C 與 30°C 之間的溫度下進行：



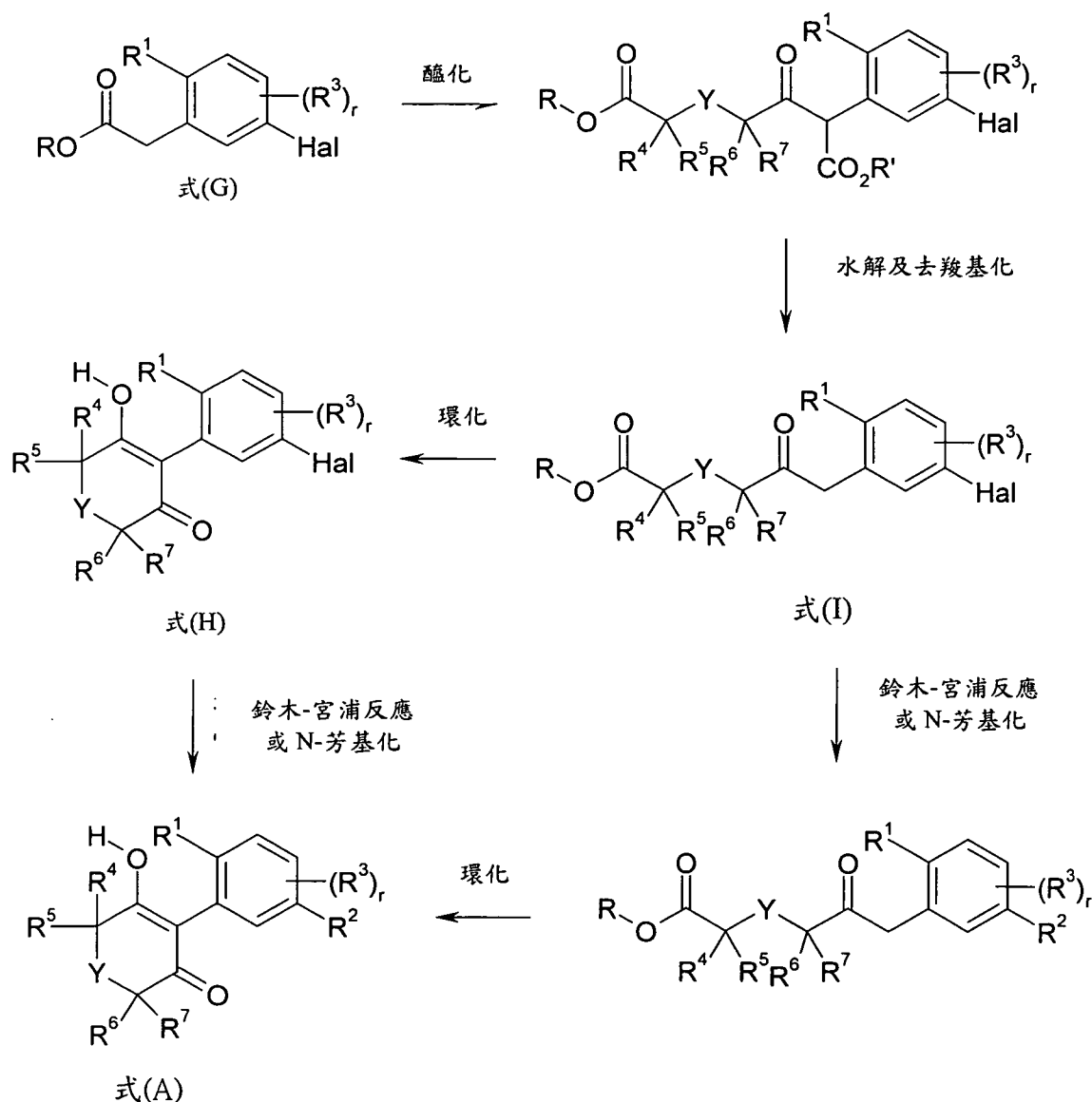
或者，其中 R 為 H 之式 (C) 化合物可藉由將式 (D) 化合物以在適合的溶劑中 (如四氫呋喃或甲苯) 的適合的鹼 (如第三丁醇鉀、雙(三甲基矽烷基)醯胺鈉及二異丙基醯胺鋰) 在適合的溫度下 (介於 -80°C 與 30°C 之間) 處理及將所得陰離子與適合的式 (F) 之酐反應而製備：



式 (E) 及式 (F) 化合物為已知的 (參見例如 T. Terasawa 和 T. Okada 於 J. Org. Chem., (1977), 42 (7), 1163-1169 及 G. Bennett, W. Houlihan, R. Mason 和 R. Engstrom 於 J. Med. Chem., (1976), 19 (5), 709-14)，或可以類似的方法從市售可取得的原料而製得。

式(H)化合物可使用類似於那些以上概述之步驟及從式(G)之鹵化苯基乙酸酯（其中 Hal 為氯、溴或碘）而製備。依次地，該化合物可藉由與偶合劑，如芳基或雜芳基硼酸 $R^2-B(OH)_2$ ，或其適合的鹽或酯在以鈀催化之條件下，較佳地在鈴木-宮浦（Suzuki-Miyaura）條件下的反應而轉化成其中 R^2 為芳基或雜芳基之式(A)化合物。

式 H 化合物特別被設計成用於式(I)化合物合成之中間物。



適合於完成式(H)之芳基鹵與式 $R^2-B(OH)_2$ 之芳基-或雜芳基硼酸，或其適合的鹽或酯之鈴木-宮浦交叉偶合反應的條件為文獻中已知的（參見例如 K. Billingsley 和 S. Buchwald 於 *J. Am. Chem. Soc.* (2007), 129, 3358-3366；H. Stefani, R. Cella 和 A. Vieira 於 *Tetrahedron*, (2007), 63, 3623-3658；N. Kudo, M. Perseghini 和 G. Fu 於 *Angew. Chem. Int. Ed.*, (2006), 45, 1282-1284；A. Roglans, A. Pla-Quintana 和 M. Moreno-Mañas 於 *Chem. Rev.* (2006), 106, 4622-4643；J-H Li, Q-M Zhu 和 Y-X Xie 於 *Tetrahedron* (2006), 10888-10895；S. Nolan 等人之 *J. Org. Chem.*, (2006), 71, 685-692；M. Lysén 和 K. Köhler 於 *Synthesis*, (2006), 4, 692-698；K. Anderson 和 S. Buchwald 於 *Angew. Chem. Int. Ed.*, (2005), 44, 6173-6177；Y. Wang 和 D. Sauer 於 *Org. Lett.*, (2004), 6 (16), 2793-2796；I. Kondolff, H. Doucet 和 M. Santelli 於 *Tetrahedron*, (2004), 60, 3813-3818；F. Bellina, A. Carpita 和 R. Rossi 於 *Synthesis* (2004), 15, 2419-2440；H. Stefani, G. Molander, C-S Yun, M. Ribagorda 和 B. Biolatto 於 *J. Org. Chem.*, (2003), 68, 5534-5539；A. Suzuki 於 *Journal of Organometallic Chemistry*, (2002), 653, 83；G. Molander 和 C-S Yun 於 *Tetrahedron*, (2002), 58, 1465-1470；G. Zou, Y. K. Reddy 和 J. Falck 於 *Tetrahedron Lett.*, (2001), 42, 4213-7215；S. Darses, G. Michaud 和 J-P. Genêt 於 *Eur. J. Org.*

Chem., (1999), 1877-1883 ; M. Beavers 等人於 WO 2005/012243 ; J. Org. Chem. (1994), 59, 6095-6097 ; A. Collier 和 G. Wagner 於 Synthetic Communications, (2006), 36, 3713-3721) 。

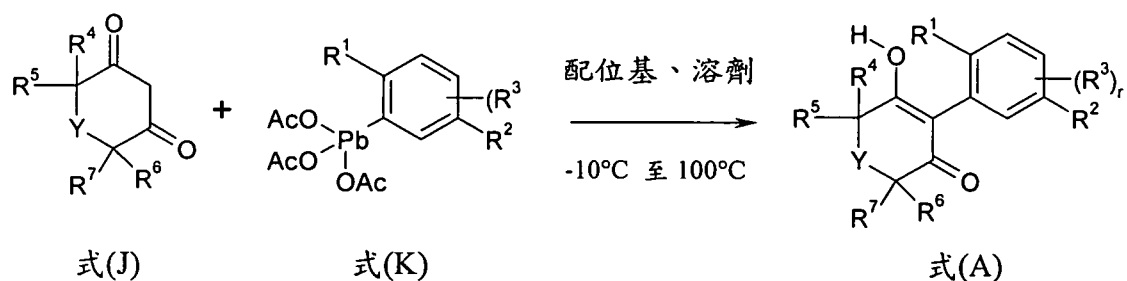
或者，式(A)化合物可藉由其中 Hal 為氯、溴、碘或假鹵素，如磺酸 C_1-C_4 鹵烷酯，尤其為三氟甲磺酸酯之式(I)化合物與式 $R^2-B(OH)_2$ 之芳基或雜芳基硼酸，或其適合的鹽或酯的鈴木-宮浦交叉偶合反應，接著藉由在先前就式(B)化合物所述之條件下的環化反應而製備。

在另外的方法中，其中 R^2 為吡啶 N-氧化物，如吡啶 N-氧化物、嘧啶 N-氧化物、噻吡啶 N-氧化物或吡嗪 N-氧化物的式(A)化合物可從式(H)化合物藉由與適合的吡啶-N-氧化物在由 L. Campeau, S. Rousseaux 和 K. Fagnou 於 J. Am. Chem. Soc., (2005), 127, 18020 及由 J-P. Leclerc 和 K. Fagnou 於 Angew. Chem. Int. Ed., (2006), 45, 7781-7786 所述之條件下反應而製備。可將所得 N-氧化與已知的試劑在已知的條件下（例如在適合的催化劑存在下以氫或甲酸銨還原）處理，以供應額外的式(I)化合物。

其中 R^2 為與苯基環經由氮原子連結的雜芳香族環之額外的式(A)化合物可藉由式(H)化合物或式(I)化合物與含有 N-H 之雜芳香族化合物 R^2-H 在適合的催化劑、適合的配位基、適合的鹼存在下及在適合的溶劑中的烏曼 (Ullmann) -型偶合反應（該反應也在文獻中已知為 N-芳基化反應）而獲得，如由例如 M. Taillefer, N. Xia 和 A. Quali

於 *Angew. Chem. Int. Ed.*, (2007), 46 (6), 934-936; H. Zhang, Q. Cai, D. Ma 於 *J. Org. Chem.*, (2005), 70, 5164-5173; J. Antilla, J. Baskin, T. Barder 和 S. Buchwald 於 *J. Org. Chem.*, (2004), 69, 5578-5587 及 A. Thomas 和 S. Ley 於 *Angew. Chem. Int. Ed.*, 2003, 42, 5400-5449 與其中的參考文獻所述。

在另外的方法中，其中 Y 為 O、S 或 C=O 之式(A)化合物可藉由式(J)化合物與三羧酸芳基鉛在適合的配位基存在下及在適合的溶劑中反應而製備。類似的反應被敘述在文獻中（例如，參考 J. Pinhey, B. Rowe 於 *Aust. J. Chem.*, (1979), 32, 1561-6; J. Morgan, J. Pinhey 於 *J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1*, (1990), 3, 715-20）。較佳地，三羧酸芳基鉛為式(K)之三乙酸芳基鉛。較佳地，配位基為含氮之雜環，如 N,N-二甲胺基吡啶、1,10-啡啉吡啶、雙吡啶或咪唑，並且較佳地使用關於式(I)化合物計 1 至 10 當量配位基。最佳地，配位基為 N,N-二甲胺基吡啶。溶劑較佳地為氯仿、二氯甲烷或甲苯，最佳地為氯仿，或氯仿與甲苯之混合物。較佳地，反應係在 -10°C 至 100°C 之溫度下進行，最佳地在 40-90°C 下。

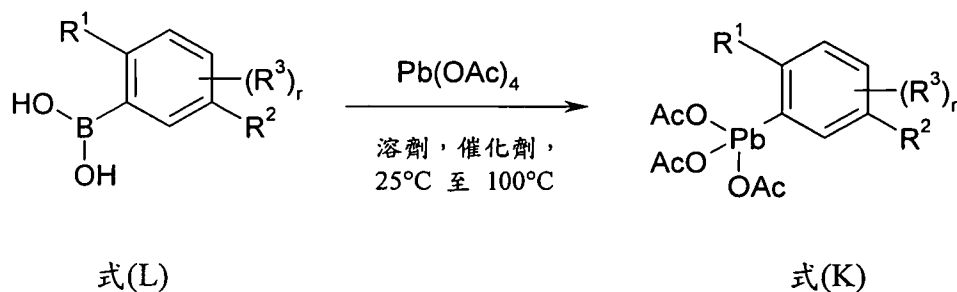


其中 Y 為 O 之式(J)化合物為已知的化合物或可藉由類似於那些在文獻中所述之途徑而製備 (參件例如 M. Morgan 和 E. Heyningen 於 J. Am. Chem. Soc., (1957), 79, 422-424 ; I. Korobitsyna 和 K. Pivnitskil 於 Russian Journal of General Chemistry, (1960), 30, 4016-4023 ; T. Terasawa 和 T. Okada 於 J. Org. Chem., (1977), 42 (7), 1163-1169 ; R. Anderson 等人之 US5089046 ; R. Altenbach, K. Agrios, I. Drizin 和 W. Carroll 於 Synth. Commun., (2004), 34 (4) 557-565 ; R. Beaudegnies 等人之 WO2005/123667 ; W. Li, G. Wayne, J. Lallaman, S. Chang 和 S. Wittenberger 於 J. Org. Chem. (2006), 71, 1725-1727 ; R. Henry, A. Khilevich, M. Kort, I. Milicic, V. Scott, J. Smith, K. Whiteaker 和 W. Carroll 於 J. Med. Chem., (2006), 49 (23), 6869-6887 ; Carroll 等人之 WO 2001/083484 A1 ; J. K. Crandall, W. W. Conover 於 J. Org. Chem., (1978), 43 (18), 3533-5 ; I. K. Korobitsyna, O. P. Studzinskii 於 Chemistry of Heterocyclic Compounds (1966), (6), 846-854) 。其中 Y 為 S 之式(J)化合物為已知的化合物或可藉由類似於那些在文獻中所述之途徑而製備 (參見例如 E. Fehnel 和 A. Paul 於 J. Am. Chem. Soc., (1955), 77, 4241-4244 ; E. Er 和 P. Margaretha 於 Helvetica Chimica Acta (1992), 75 (7), 2265-69 ; H. Gayer 等人之 DE 3318648 A1) 。

其中 Y 為 C=O 之式(J)化合物為已知的化合物或可藉由類似於那些在文獻中所述之途徑而製備 (參見例如 R. Götz

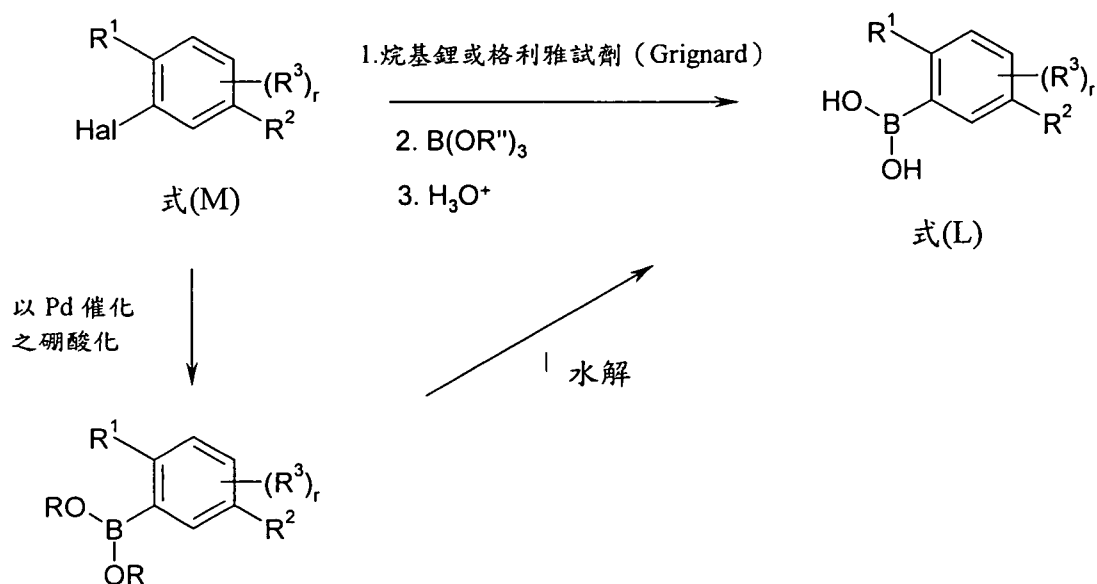
和 N. Götz 之 WO 2001/060776 ; R. Götz 等人之 WO 2000/075095 ; M. Benbakkar 等人於 Synth. Commun. (1989), 19 (18), 3241-3247 ; S. Jain 和 T. Seshadri 於 Proc. Indian Acad. Sci. Sect. A., (1955), 42, 279 ; N. Ahmad 等人於 J. Org. Chem., (2007), 72 (13), 4803-4815 ; F. Effenberger 等人之 Chem. Ber., (1986), 119, 3394-3404 與其中的參考文獻)。

式(K)化合物可從式(L)化合物而製備，其係藉由以在適合的溶劑中（例如，氯仿）的四乙酸鉛在 25°C 至 100°C 下（較佳地為 25-50°C）及視需要在催化劑，如二乙酸汞的存在下根據在文獻中所述之步驟而處理（例如，參見 K. Shimi, G. Boyer, J-P. Finet 和 J-P. Galy 於 Letters in Organic Chemistry, (2005), 2, 407-409 ; J. Morgan 和 J. Pinhey 於 J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 ; (1990), 3, 715-720)。



式(L)之芳基硼酸可從其中 Hal 為溴或碘之式(M)之芳基鹵藉由已知的方法而製備（參見例如 W. Thompson 和 J. Gaudino 於 J. Org. Chem., (1984), 49, 5237-5243 及 R. Hawkins 等人於 J. Am. Chem. Soc., (1960), 82, 3053-3059）。因此，式(M)之芳基鹵可以鹵化烷基鋰或烷基鎂在低溫下處理，並允許所獲得的芳基鎂或芳基鋰試劑與硼

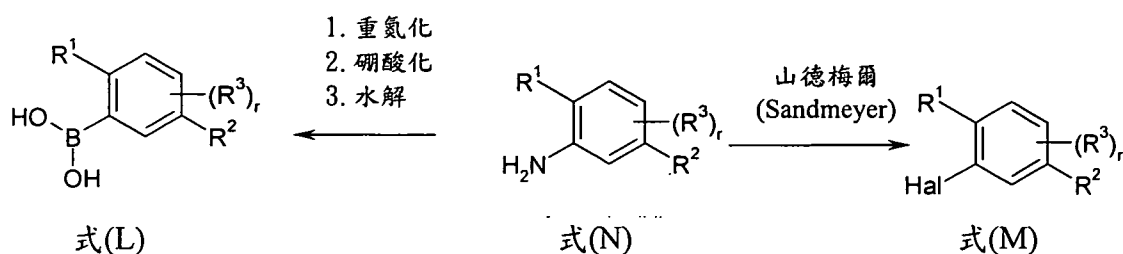
酸三烷酯 $B(OR'')_3$ ，較佳地為硼酸酸甲酯反應，得到二烷基硼酸芳酯，可將其在酸性條件下水解成所欲之式(L)之硼酸。或者，化合物(M)成為化合物(L)之相同的整體轉變作用可經由在使用已知試劑的已知條件下以鈀催化之硼酸化反應(參見例如 T. Ishiyama, M. Murata, N. Miyaura 於 J. Org. Chem., (1995), 60, 7508-7501；及 K. L. Billingsley, T. E. Barder, S. L. Buchwald 於 Angew. Chem. Int. Ed. (2007), 46, 5359-5363)，接著藉由中間物硼酸酯的水解而達成。



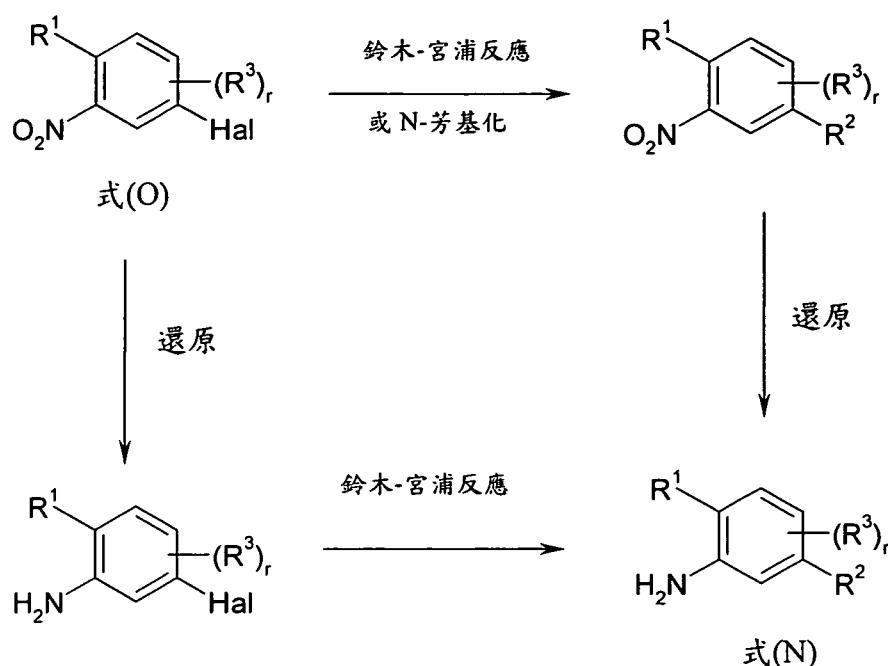
式(M)之芳基鹵為已知的化合物，或可藉由已知的方法從已知的化合物而製得。例如，式(M)之芳基鹵可從式(N)之苯胺經由對應之重氮鹽的已知方法而製備，例如，以山德梅爾(Sandmeyer)反應(參見例如 John Wiley and Sons 的 J. March 於第三版 Advanced Organic Chemistry 的第 647-648 頁與其中的參考文獻)。額外的實例也參考 W. Denny 等人於 J. Med. Chem., (1991), 34, 217-222；P. Knochel 等

人於 *Synthesis*, (2007), No. 1, 81-84。

另外，式(N)化合物可經由中間物芳基重氮鹽在使用已知試劑的已知條件下以鈀催化之硼酸化反應（參見例如 D. M. Willis, R. M. Strongin 於 *Tetrahedron Lett.*, (2004), 41, 8683-8686），接著藉由中間物硼酸酯的水解而直接轉化成式(L)化合物。



式(N)之苯胺為已知的化合物，或可從已知的化合物藉由已知的方法而製得。例如，式(N)之苯胺可從式(O)之硝苯（其中 Hal 為氯、溴、碘或假鹵素，如磺酸 C_1-C_4 鹵烷酯，尤其為三氟甲磺酸酯）而製備，該製備係藉由與芳基-或雜芳基硼酸， $R^2-B(OH)_2$ ，或其適合的鹽或酯在鈴木-宮浦條件下，或與含有 N-H 之雜芳香族環， R^2-H 在 N-芳基化條件下反應，接著藉由標準的方法還原硝基。或者，式(O)化合物可先還原成苯胺及苯胺在鈴木-宮浦條件下交叉偶合（參見例如 A. Maj. L. Delaude, A. Demonceau 和 A. Noels 於 *Tetrahedron*, (2007), 63, 2657-2663; F. Bellina, A. Carpita 和 R. Rossi 於 *Synthesis* (2004), 15, 2419-2440; 及 A. Suzuki 於 *Journal of Organometallic Chemistry*, (2002), 653, 83-90)。

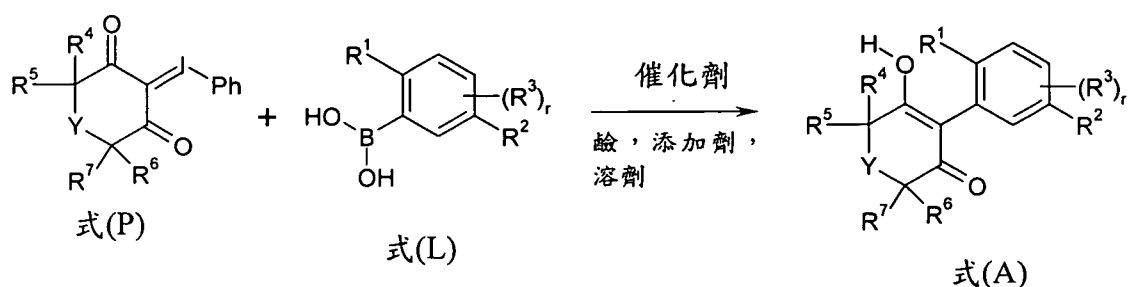


式(O)之硝苯為已知的化合物，或可從已知的化合物藉由已知的方法而製備。

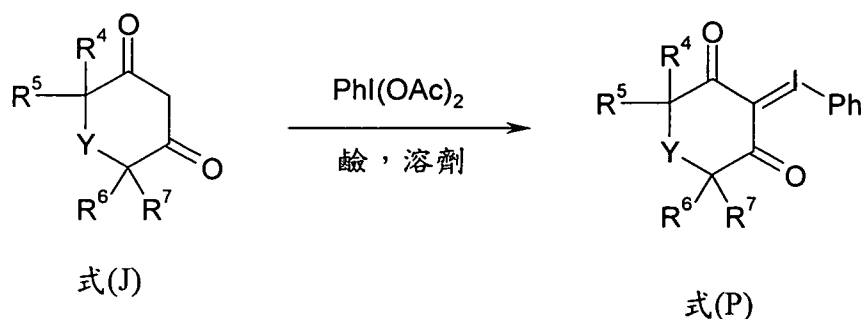
在另外的方法中，式(A)化合物可從式(P)化合物藉由與式(L)之芳基硼酸在適合的鈀催化劑及鹼的存在下反應而製備，較佳地在適合的溶劑中。適合的鈀催化劑通常為鈀(II)或鈀(0)錯合物，例如二鹵化鈀(II)、乙酸鈀(II)、硫酸鈀(II)、二氯化雙(三苯膦)鈀(II)、二氯化雙(三環戊膦)鈀(II)、二氯化雙(三環己膦)鈀(II)、雙(二亞苯甲基丙酮)鈀(0)或肆(三苯膦)鈀(0)。鈀催化劑也可從鈀(II)或鈀(0)化合物藉由與所欲之配位基錯合而“當場”製備，例如，藉由將欲錯合之鈀(II)鹽，例如二氯化鈀(II) (PdCl_2) 或乙酸鈀(II) ($\text{Pd}(\text{OAc})_2$) 與所欲之配位基，例如三苯膦 (PPh_3)、三環戊膦或三環己膦及所選擇的溶劑與式(P)化合物、式(L)化合物及鹼一起組合。雙芽配位基也適合，例如 1,1'-雙(二

苯膦基)二茂鐵或 1,2-雙(二苯膦基)乙烷。C-C 偶合反應所欲之鈀(II)錯合物或鈀(0)錯合物係藉由加熱反應介質而因此“當場”形成，並接著引發 C-C 偶合反應。

鈀催化劑係以式(P)化合物為基準從 0.001 至 50mol% 之量被使用，較佳地以從 0.1 至 15mol% 之量。更佳地，鈀來源為乙酸鈀，鹼為氫氧化鋰及溶劑為 1,2-二甲氧基乙烷與水以 4:1 至 1:4 之比的混合物。反應也可在其他的添加劑存在下進行，如四烷基銨鹽，例如溴化四丁基銨：

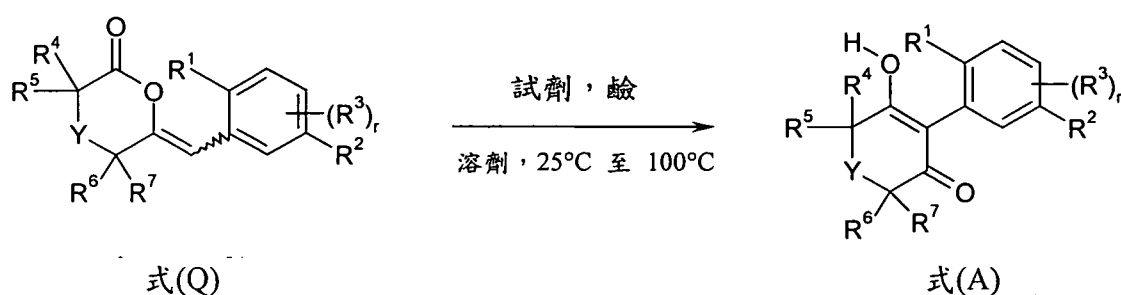


式(P)化合物可從式(J)化合物藉由根據 K. Schank 和 C. Lick 於 Synthesis, (1983), 392-395 或 Z. Yang 等人於 Org. Lett. (2002), 4 (19), 3333-3336 之步驟以(二乙醯氧基)碘苯的處理而製備：

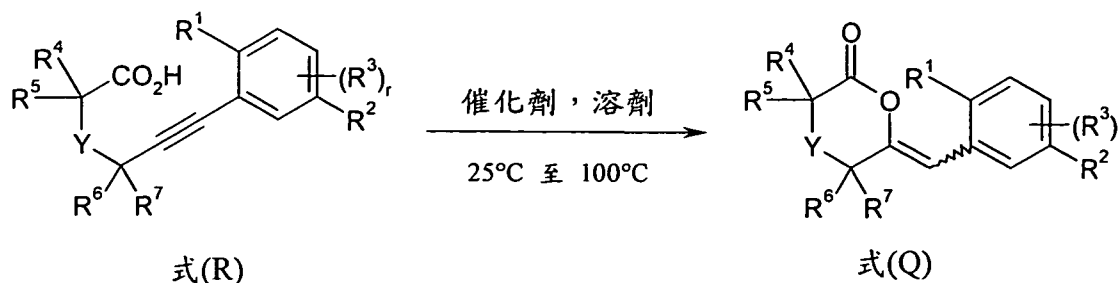


在另外的方法中，式(A)化合物可經由在促進重排之試

劑，如金屬烷醇化物（較佳地，以關於式(Q)化合物計等於或大於 100% 之量）或氰化物陰離子（例如，0.001-25% 之氰化鉀，0.001-25% 之氰化鈉）或氰醇（較佳地，以關於式(Q)化合物計 0.001-25% 之丙酮氰醇）的存在下重排式(Q)化合物而製備。該反應視需要在適合的溶劑中（例如，乙腈）於適合的溫度下（典型地，25-100°C）及以適合的鹼（如三乙胺）執行。

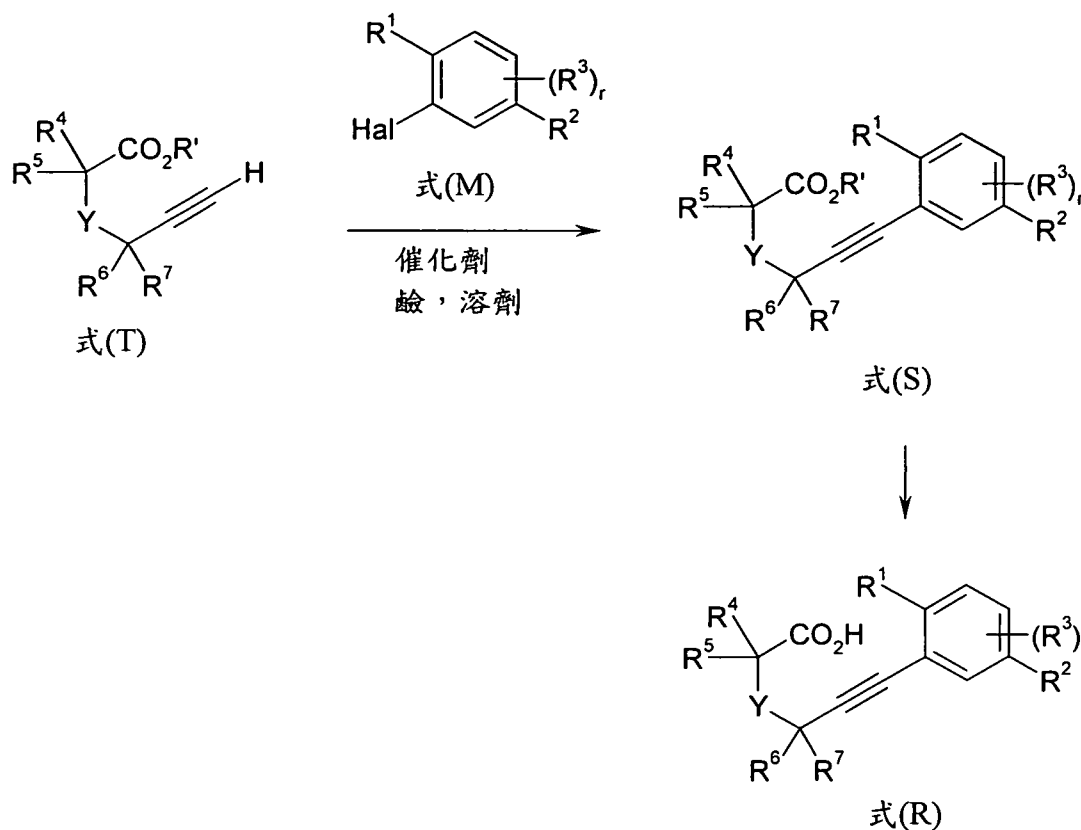


式(Q)化合物可從式(R)化合物藉由在適合的溶劑存在下（例如，乙腈）於適合的溫度下（典型地，25°C 至 150°C）及視需要在微波照射下以促進內酯化反應之催化劑（如二氯化鈹(II)、氯化金(I)或碳酸銀），較佳地以關於式(R)化合物計 0.001-50% 之碳酸銀處理而製備。類似的內酯化反應為文獻中已知的（參見例如 P. Huang 和 W. Zhou 於 *Tetrahedron Asymmetry* (1991), 2 (9), 875-878; 及 H. Harkat, J-M, Weibel, P. Pale 於 *Tetrahedron Letters* (2006), 47 (35), 6273-6276）。



式(R)化合物可藉由其中 R' 為烷基（較佳地為甲基或乙基）之式(S)化合物水解而製備，而式(S)化合物可從式(T)化合物而製備，該製備係藉由與式(M)化合物在適合的鈀催化劑（例如，二氯化雙(三苯膦)鈀(II)、肆(三苯膦)鈀(0)或乙酸鈀在適合的配位基存在下）存在下的索諾加蘇羅（Sonogashira）偶合反應，該催化劑典型地具有以式(T)化合物計 0.001-25% 之量，該製備視需要在適合的銅共同催化劑（例如，典型地具有以式(T)化合物計 0.001-50% 之量的碘化亞銅(I)），適合的鹼（如二乙胺、三乙胺、六氫吡啶或吡咯啶）的存在下，該鹼也可被用作溶劑，或視需要在替換的溶劑中，如 1,4-二噁烷、N,N-二甲基乙醯胺或 N,N-二甲基甲醯胺，及視需要在微波照射下反應。類似的索諾加蘇羅偶合反應為文獻中已知的（參見例如 S. Hagen, M. Huband, W. Jiao, T. Kaneko, S. N. Maiti, M. Meinick, K. Romero, M. Patterson, X. Wu 於 *Bioorganic and Medicinal Chemistry Letters* (2006), 16 (20), 5392-5397；N. Leadbeater 和 B. Tominack 於 *Tetrahedron Lett.*, (2003), 8653-8656；Z. Gan 和 R. Roy 於 *Canadian Journal of Chemistry* (2002), 80 (8), 908-916；及 K. Sonogashira 於 *J. Organomet. Chem.*,

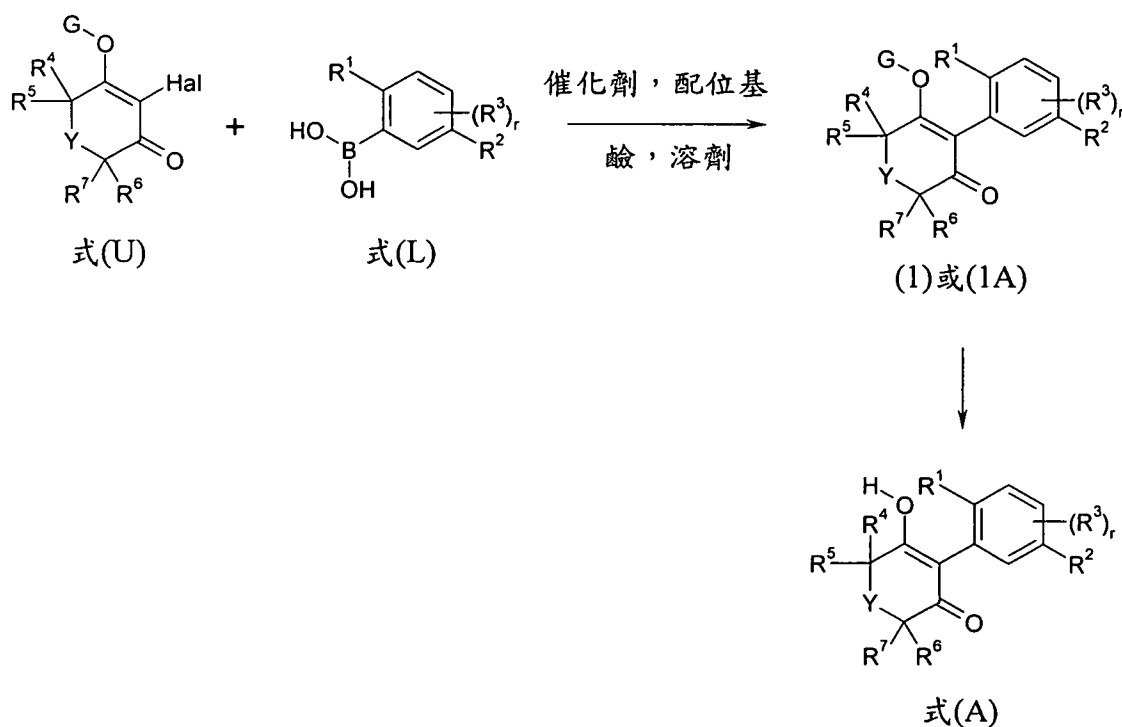
(2002), 653, 46-49 與其中的參考文獻)。



式(T)化合物為已知的化合物，或可藉由類似於那些在文獻中所述之途徑而製備（參見例如 I. Drizin 等人於 WO 2001/066544；M. Yamamoto 於 Journal of Chemistry Research, Synopses (1991), (7), 165；P. Machin 於 US4774253；M. Morgan 和 E. Heyningen 於 J. Am. Chem. Soc., (1957), 79, 422-424；N. Petiniot, A. J. Anciaux, A. F. Noels, A. J. Hubert, P. Teyssie 於 Tetrahedron letters, 1978, 14, 1293-42；及 A. F. Noels, A. Demonceau, N. Petiniot, A. J. Hubert, P. Teyssie 於 Tetrahedron (1982), 38 (17), 2733-9)。

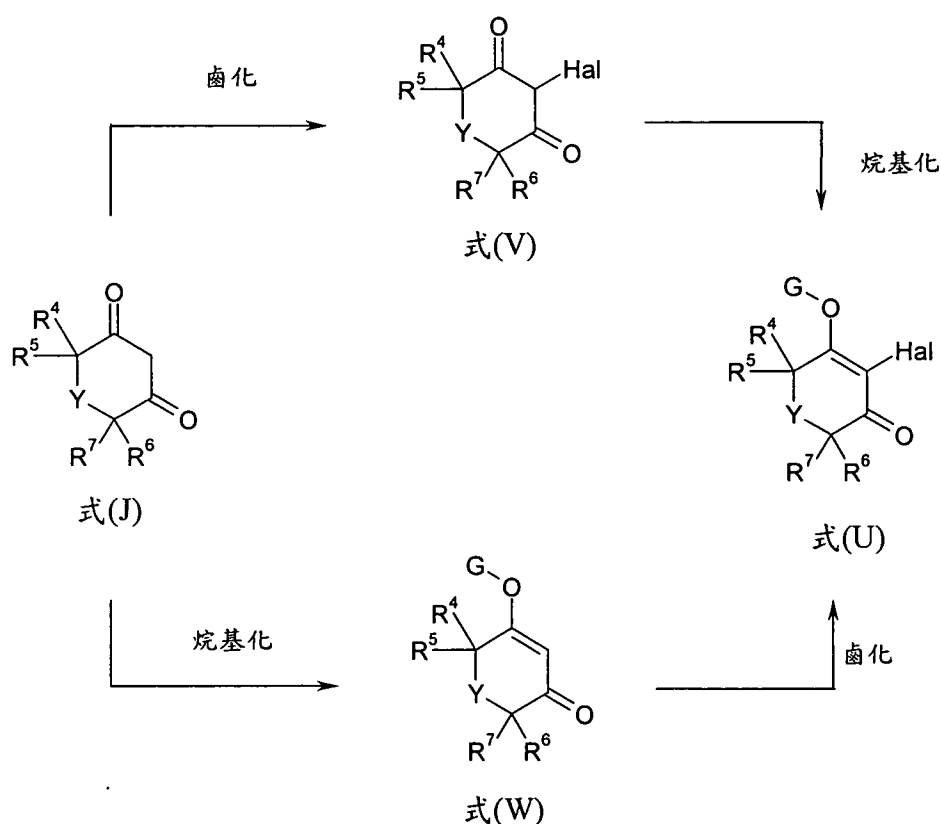
在另外的方法中，式(A)化合物可從式(I)或(1A)化合物（其中 G 為 C₁₋₄ 烷基）藉由水解而製備，較佳地，在酸催

化劑，如氫氯酸的存在下及視需要在適合的溶劑，如四氫呋喃的存在下。式(I)或(1A)化合物（其中 G 較佳地為 C₁₋₄ 烷基）可藉由將式(U)化合物（其中 G 較佳地為 C₁₋₄ 烷基及 Hal 為鹵素，較佳地為溴或碘）與式(L)之芳基硼酸在適合的鈰催化劑（例如，以關於式(U)化合物計 0.001-50% 之乙酸鈰(II)）與鹼（例如，以關於式(U)化合物計 1 至 10 當量磷酸鉀）存在下及較佳地在適合的配位基（例如，以關於式(U)化合物計 0.001-50% 之(2-二環己膦基)-2',6'-二甲氧基聯苯）存在下及在適合的溶劑中（例如，甲苯）於較佳地介於 25°C 與 200°C 之間反應而製備。類似的偶合反應為文獻中已知的（參見例如 Y. Song, B. Kim 和 J. -N. Heo 於 Tetrahedron Letters (2005), 46 (36), 5987-5990）。



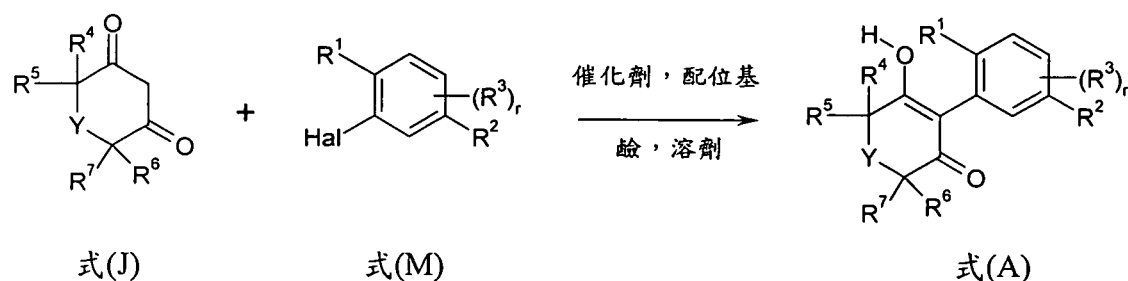
式(U)化合物可藉由鹵化式(J)化合物，接著將所得式(V)

之鹵化物與 C_{1-4} 烷基鹵或原甲酸三- C_{1-4} 烷酯在已知條件下的烷基化反應而製備，例如藉由 R. Shepherd 和 A. White (J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1 (1987), 2153-2155) 及 Y. -L. Lin 等人 (Bioorg. Med. Chem. (2002), 10, 685-690) 之步驟。或者，式(U)化合物可藉由將式(J)化合物以烷基化劑，如 C_{1-4} 烷基鹵或原甲酸三- C_{1-4} 烷酯烷基化及將所得式(W)之烯酮在已知的條件下鹵化而製備（參見例如 Y. Song, B. Kim 和 J. -N. Heo 於 Tetrahedron Letters (2005), 46 (35), 5987-5990）。



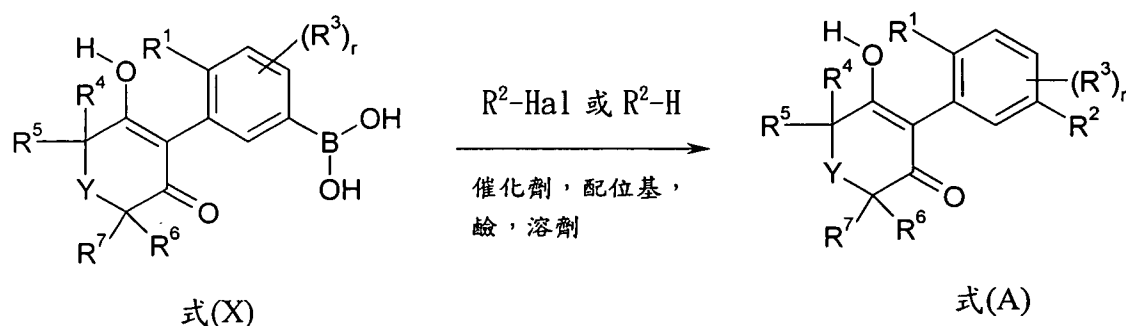
在另外的方法中，式(A)化合物可藉由將式(J)化合物與式(M)化合物反應而製備，該製備係在適合的鈀催化劑（例如，以關於式(J)化合物計 0.001-50% 之乙酸鈀(II)）

與鹼（例如，以關於式(J)化合物計 1 至 10 當量磷酸鉀）存在下及較佳地在適合的配位基（例如，以關於式(J)化合物計 0.001-50% 之(2-二環己膦基)-2',4',6'-三異丙基聯苯）存在下及在適合的溶劑中（例如，二噁烷）於較佳地介於 25°C 與 200°C 之間及視需要在微波加熱下反應。類似的偶合反應為文獻中已知的（參見例如 J. Fox, X. Huang, A. Chieffi, S. Buchwald 於 J. Am. Chem. Soc. (2000), 122, 1360-1370；B. Hong 等人於 WO 2005/000233）。或者，式(A)化合物可藉由將式(J)化合物與式(M)化合物反應而製備，該製備係在適合的銅催化劑（例如，以關於式(J)化合物計 0.001-50% 之碘化亞銅(I)）與鹼（例如，以關於式(J)化合物計 1 至 10 當量碳酸鈉）存在下及較佳地在適合的配位基（例如，以關於式(J)化合物計 0.001-50% 之 L-脯氨酸）存在下及在適合的溶劑中（例如，二甲基亞砷）於較佳地介於 25°C 與 200°C 之間反應。類似的偶合反應為文獻中已知的（參見例如 Y. Jiang, N. Wu, H. Wu, M. He 於 Synlett., (2005), 18, 2731-2734, X. Xie, G. Cai, D. Ma 於 Organic Letters (2005), 7 (21), 4693-4695）。



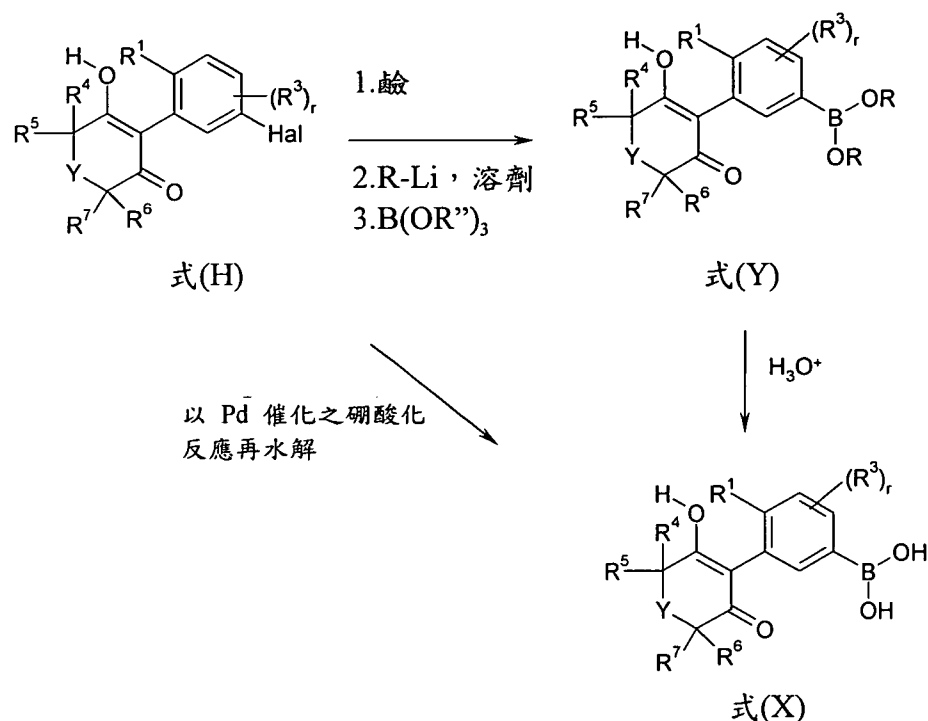
在另外的方法中，式(A)化合物可從式(X)化合物而製

備，該製備係藉由與其中 Hal 較佳地為氯、溴、碘或假鹵化物，如磺酸 C_1-C_4 鹵烷酯，尤其為三氟甲磺酸酯之芳基-或雜芳基鹵化物， R^2 -Hal 在先前所述之鈴木-宮浦條件下，或與含有 N-H 之雜芳香族化合物， R^2 -H 在以銅催化之條件下的交叉偶合反應，如例由 P. Lam 等人於 *Tetrahedron Lett.*, (1998), 39 (19), 2941-2944；及 P. Lam, G. Vincent, C. G. Clark, S. Deudon, P. K. Jadhav 於 *Tetrahedron Lett.*, (2001), 42, 3415-3418 所述。式 X 化合物特別被設計成用於合成式(I)化合物之中間物。

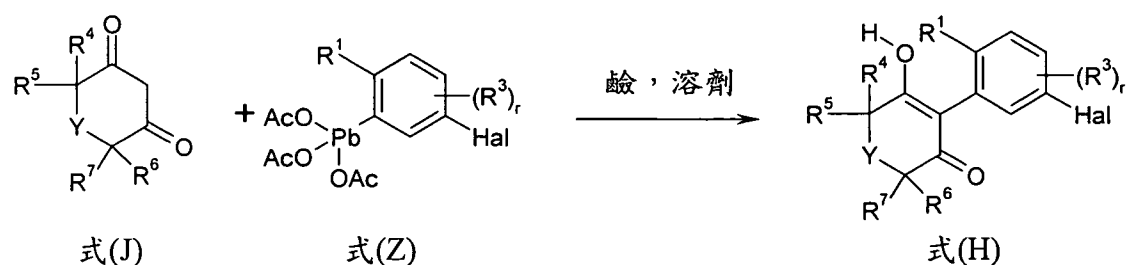


式(X)化合物可從式(H)化合物（其中 Hal 較佳地為碘或溴）而製備，該製備係藉由以適合的鹼（如氫化鈉或氫化鉀）在適合的溶劑中（如四氫呋喃或二乙胺）處理，接著藉由金屬-鹵素交換反應（較佳地藉由以烷基鋰試劑，如正-丁基鋰、第二丁基鋰或第三丁基鋰，或有機鎂試劑，如氯化異丙基鎂處理）及接著以硼酸三烷酯 $B(OR'')_3$ （較佳地為硼酸三甲酯）處理，得到式(Y)之硼酸芳酯。式(Y)化合物可在酸性條件下水解，得到式(X)之硼酸。或者，式(X)化合物可從式(H)化合物（其中 Hal 較佳地為碘、溴、鹵或

假鹵化物，如磺酸 C_1-C_4 鹵烷酯，尤其為三氟甲磺酸酯）在類似於那些製備化合物(L)所參考之已知的以鈀催化之硼酸化反應條件下而製備。

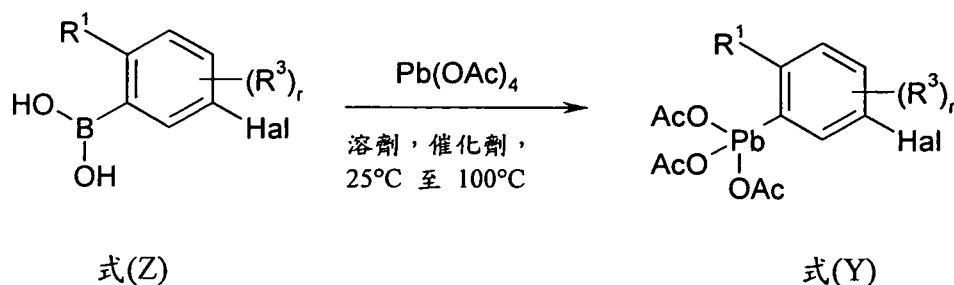


式(H)化合物可如先前所述而製備。或者，式(H)化合物可從式(J)化合物而製備，該製備係藉由與式(Z)化合物在類似於那些用於從式(K)化合物製備式(A)化合物的條件下反應。



式(Z)化合物可從式(Y)化合物藉由類似於那些用於從

式(L)化合物製備式(K)化合物所述之方法而製備。



式(Z)化合物為已知的化合物（參見例如 R. Bhatt 等人於 US2004/0204386），或可藉由已知的方法從已知的化合物而製備，如例用於製備式(L)化合物所述之方法。

根據本發明的式 I 化合物可以如合成法中所獲得的未經修改之形式被用作除草劑，但是彼等通常以各種方式使用調配佐劑，如載劑、溶劑及表面活性物質而調配成除草組成物。調配物可具有各種物理形式，例如具有粉劑、凝膠、可濕性粉劑、水分散性顆粒、水分散性錠劑、泡騰壓製錠劑、可乳化濃縮劑、可微乳化濃縮劑、水包油型乳液、油懸劑、水性分散劑、油性分散劑、懸乳劑、膠囊懸浮劑、可乳化顆粒、可溶性液體、水溶性濃縮劑（具有水與水互溶之有機溶劑作為載劑）、浸漬型聚合物膜的形式或從例如 1999 年的第 5 版植物保護產品的發展及 FAO 規格的使用手冊（Manual on Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products）已知的其他型式。該等調配物可直接被使用或在使用之前被稀釋。稀釋之調配物可以例如水、液體肥料、微營養素、生物有機體、油或溶劑製備。

調配物可以例如藉由將活性成分與調配佐劑混合而製備，以便獲得具有細碎的固體、顆粒、溶液、懸浮液或乳液型式的組成物。活性成分也可與其他佐劑調配，例如細碎的固體、礦物油、植物油、修改之植物油、有機溶劑、水、表面活性物質或其組合物。活性成分也可包括在由聚合物所組成的非常細微膠囊中。微膠囊包括在多孔載劑中的活性成分。該載劑能夠使活性成分以受控制的量釋放至其周圍中（例如，緩慢釋放）。微膠囊經常具有從 0.1 至 500 微米的直徑。彼等包括具有以膠囊重量計從約 25 至 95 % 之量的活性成分。活性成分可以單片固體形式、在固體或液體分散劑中的粒子形式或適合的溶液形式存在。包膠膜包含例如天然及合成膠、纖維素、苯乙烯-丁二烯共聚物、聚丙烯腈、聚丙烯酸酯、聚酯、聚醯胺、聚尿素、聚胺基甲酸酯或化學修改之聚合物及黃原酸澱粉或熟習所屬相關技術領域者已知的其他聚合物。或者，有可能形成其中活性成分以細碎的粒子形成存在於基底物質的固體基質中的非常細微膠囊，但是在該例子中，微膠囊未包膠。

適合於製備根據本發明的組成物的調配佐劑就其本身而言為已知的。可使用下列者作為液體載劑：水、甲苯、二甲苯、石油醚、植物油、丙酮、甲乙酮、環己酮、酸酐、乙腈、乙醯苯、乙酸戊酯、2-丁酮、碳酸丁烯酯、氯苯、環己烷、環己醇、乙酸之烷酯、二丙酮醇、1,2-二氯丙烷、二乙醇胺、對-二乙苯、二甘醇、松脂酸二甘醇酯、二甘醇丁醚、二甘醇乙醚、二甘醇甲醚、N,N-二甲基甲醯胺、二

甲基亞砷、1,4-二噁烷、二伸丙甘醇、二伸丙甘醇甲醚、二苯甲酸二伸丙甘醇酯、二普西托 (diproxitol)、烷基吡咯啉酮、乙酸乙酯、2-乙基己醇、碳酸乙烯酯、1,1,1-三氯乙烷、2-庚酮、 α -蒎烯、d-萘、乳酸乙酯、乙二醇、乙二醇丁醚、乙二醇甲醚、 γ -丁內酯、甘油、乙酸甘油酯、二乙酸甘油酯、三乙酸甘油酯、十六烷、己二醇、乙酸異戊酯、乙酸異苡酯、異辛烷、異佛酮、異丙苯、肉豆蔻酸異丙酯、乳酸、月桂胺、亞異丙基丙酮、甲氧基丙醇、甲基異戊酮、甲基異丁酮、月桂酸甲酯、辛酸甲酯、油酸甲酯、二氯甲烷、間-二甲苯、正-己烷、正-辛胺、十八烷酸、乙酸辛胺酯、油酸、油胺、鄰-二甲苯、酚、聚乙二醇 (PEG 400)、丙酸、乳酸丙酯、碳酸丙烯酯、丙二醇、丙二醇甲醚、對-二甲苯、甲苯、磷酸三乙酯、三伸乙甘醇、二甲苯磺酸、石蠟、礦物油、三氯乙烯、過氯乙烯、乙酸乙酯、乙酸戊酯、乙酸丁酯、丙二醇甲醚、二甘醇甲醚、甲醇、乙醇、異丙醇及高分子量醇類，如戊醇、四氫呋喃醇、己醇、辛醇、乙二醇、丙二醇、甘油、N-甲基-2-吡咯啉酮與類似物。水通常是稀釋濃縮劑的載劑選擇。適合的固體載劑為例如滑石粉、二氧化鈦、葉蠟石黏土、二氧化矽、鎂鋁海泡石黏土、矽藻土、石灰石、碳酸鈣、膨土、鈣蒙脫石、綿籽殼、小麥粉、大豆粉、浮石、木粉、研磨之核桃殼、木質素及類似的材料，如例在 CRF 180.1001. (c) & (d) 中所述。

大多數表面活性物質被有利地用在固體及液體調配物二者中，尤其在那些在使用之前可以載劑稀釋的調配物

中。表面活性物質可為陰離子、陽離子、非離子或聚合物，並被用作乳化、濕潤或懸浮劑或其他目的。典型的表面活性物質包括例如烷基硫酸之鹽類，如月桂基硫酸二乙醇銨；烷芳基磺酸之鹽類，如十二烷基苯磺酸鈣；烷酚-環氧烷烴加成產物，如壬酚乙氧基化合物；醇-環氧烷烴加成產物，如三癸醇乙氧基化合物；肥皂，如硬脂酸鈉；烷萘磺酸之鹽類，如二丁萘磺酸鈉；磺基丁二酸鹽之二烷酯，如二(2-乙己基)磺基丁二酸鈉；山梨醇酯，如油酸山梨醇酯；四級胺，如氯化月桂基三甲基銨；脂肪酸之聚乙二醇酯，如聚硬脂酸乙二醇酯；環氧乙烷與環氧丙烷之嵌段共聚物；及單-及二-烷基磷酸酯之鹽類；及也在例如紐澤西州 Ridgewood 之 MC 出版公司於 1981 年之 "McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annuals" 中所述之另外的物質。

經常可用在殺害蟲調配物中的更多佐劑包括結晶抑制劑、黏度修改物質、懸浮劑、染料、抗氧化劑、起泡劑、光吸收劑、混合輔助劑、除泡劑、複合劑、中和或 pH-修改物質與緩衝劑、腐蝕抑制劑、香料、濕潤劑、吸收改良劑、微營養素、增塑劑、助滑劑、潤滑劑、分散劑、增稠劑、抗冷凝劑、微生物殺菌劑及也為液體與固體肥料。

調配物也可包含額外的活性物質，例如更多的除草劑、除草劑安全劑、植物生長調節劑、殺真菌劑或殺昆蟲劑。

根據本發明的組成物可另外包括含有植物或動物來源之油、礦物油、該等油的烷酯或該等油及油衍生物之混合物的添加劑。在根據本發明的組成物中所使用的添加劑之

量通常係以噴霧混合物為基準計從 0.01 至 10%。例如，在已製備好噴霧混合物之後，可將油添加劑以所欲之濃度加入噴霧槽中。較佳的油添加劑包含礦物油或植物來源之油，例如油菜籽油、橄欖油或向日葵油；乳化之植物油，如 AMIGO® (Rhône-Poulenc Canada Inc.)；植物來源之油的烷酯，例如甲基衍生物，或動物來源之油的烷酯，如魚油或牛肉脂。較佳的添加劑包括例如基本上 80 重量%之魚油之烷酯及 15 重量%之甲基化油菜籽油作為活性組份，並也包括 5 重量%之習知的乳化劑及 pH 修改劑。尤其佳的油添加劑包含 C_8 - C_{22} 脂肪酸之烷酯，尤其為 C_{12} - C_{18} 脂肪酸之甲基衍生物，例如月桂酸、棕櫚酸及油酸之甲酯為重要的添加劑。那些酯已知為月桂酸甲酯 (CAS-111-82-0)、棕櫚酸甲酯 (CAS-112-39-0) 及油酸甲酯 (CAS-112-62-9)。較佳的脂肪酸甲酯衍生物為 Emery® 2230 及 2231 (Cognis GmbH)。那些及其他的油衍生物也從南伊利諾大學於 2000 年的第 5 版之 Compendium of Herbicide Adjuvants 已知。

油添加劑的施予及作用可藉由將彼等與表面活性物質，如非離子、陰離子或陽離子界面活性劑組合而進一步改進。適合的陰離子、非離子及陽離子界面活性劑的實例陳列在 WO 97/34485 的第 7 及 8 頁中。較佳的表面活性物質為十二烷基苯磺酸鹽類型，尤其為其鈣鹽之陰離子界面活性劑，並也為脂肪醇乙氧基化合物類型之非離子界面活性劑。特別優先選擇具有從 5 至 40 之乙氧基化程度之乙

氧基化 C_{12} - C_{22} 脂肪醇。市售可取得的界面活性劑的實例為 Genapol 類型 (Clariant AG)。也較佳的是聚矽氧界面活性劑，尤其為聚烷基化氧修改之七甲基三矽氧烷，其為市售可取得的例如 Silwet L-77®，並也為全氟化界面活性劑。與總添加劑有關的表面活性物質之濃度通常從 1 至 30 重量%。由油或礦物油或其衍生物與界面活性劑之混合物所組成的油添加劑的實例為 Edenor ME SU®、Turbocharge® (Snygenta AG, CH) 及 Actipron® (BP Oil UK Limited, GB)。

該表面活性物質也可單獨用在調配物中，換言之，沒有油添加劑。

而且，加入油添加劑 / 界面活性劑混合物中的有機溶劑可貢獻另外的作用增強性。適合的溶劑為例如 Solvesso® (ESSO) 及 Aromatic Solvent® (Exxon 公司)。該等溶劑的濃度可以總重量計從 10 至 80 重量%。可與溶劑摻合的該等油添加劑的濃度被敘述在例如 US-A-4 834 908 中。在本文所揭示之市售可取得的油添加劑係以名稱 MERGE® (BASF 公司) 已知。根據本發明較佳的另外的油添加劑為 SCORE® (Syngenta Crop Protection Canada)。

除了上述所列之油添加劑之外，為了增強根據本發明的組成物之活性，故也有可能將烷基吡咯啉酮之調配物 (例如，Agrimax®) 加入噴霧混合物中。也可使用合成乳膠之調配物，像是例如聚丙烯醯胺、聚乙烯基化合物或聚-1-對-孟烯 (例如，Bond®、Courier®或 Emerald®)。包括丙酸

之溶液，例如 Eurogkem Pen-e-trate®也可混合至噴霧混合物中，作為活性增強劑。

除草調配物通常包從 0.1 至 99 重量%，尤其從 0.1 至 95 重量%之式 I 化合物及從 1 至 99.9 重量%之調配佐劑，其較佳地包括從 0 至 25 重量%之表面活性物質。反之，市售商品較佳地被調配成濃縮劑，而最終使用者一般係使用稀釋的調配物。

式 I 化合物的施予率可在寬廣的限度內改變，並依據土壤性質、施予方法（萌芽前或後、種子披覆、施予種溝、非耕種農作物上的施予等）、農作植物、欲控制之雜草或禾草、當時的氣候條件及由施予方法、施予時間與標的農作物所支配的其他因素而定。根據本發明的式 I 化合物通常以 1 至 4000 公克 / 公頃之施予率施予，尤其從 5 至 1000 公克 / 公頃。

較佳的調配物尤其具有下列組成物：

（% = 重量百分比）

可乳化濃縮劑：

活性成分：1 至 95%，較佳地為 60 至 90%

表面活性劑：1 至 30%，較佳地為 5 至 20%

液體載劑：1 至 80%，較佳地為 1 至 35%

粉劑：

活性成分：0.1 至 10%，較佳地為 1 至 35%

固體載劑：99.9 至 90%，較佳地為 99.9 至 99%

懸浮濃縮劑：

活性成分： 5 至 75%，較佳地為 10 至 50%

水： 94 至 24%，較佳地為 88 至 30%

表面活性劑： 1 至 40%，較佳地為 2 至 30%

可濕性粉劑：

活性成分： 0.5 至 90%，較佳地為 1 至 80%

表面活性劑： 0.5 至 20%，較佳地為 1 至 15%

固體載劑： 5 至 95%，較佳地為 15 至 90%

顆粒：

活性成分： 0.1 至 30%，較佳地為 0.1 至 15%

固體載劑： 99.5 至 70%，較佳地為 97 至 85%

下列的實施例進一步說明本發明，但不是限制。

<u>F1.可乳化濃縮劑</u>	a)	b)	c)	d)
活性成分	5%	10%	25%	50%
十二烷基苯磺酸鈣	6%	8%	6%	8%
蓖麻油聚乙二醇醚	4%	-	4%	4%
(36 莫耳之環氧乙烷)				
辛酚聚乙二醇醚	-	4%	-	2%
(7-8 莫耳之環氧乙烷)				
NMP	-	-	10%	20%
芳香族烴混合物 C ₉ -C ₁₂	85%	78%	55%	16%

任何所欲濃度之乳劑可從該濃縮劑藉由以水稀釋而製備。

<u>F2.溶液</u>	a)	b)	c)	d)
活性成分	5%	10%	50%	90%

1-甲氧基-3-(3-甲氧基丙氧基)-丙烷	-	20%	20%	-
聚乙二醇 MW 400	20%	10%	-	-
NMP	-	-	30%	10%
芳香族烴混合物 C ₉ -C ₁₂	75%	60%	-	-

該溶液適合以微滴形式施予。

<u>F3.可濕性粉劑</u>	a)	b)	c)	d)
活性成分	5%	25%	50%	80%
木質磺酸鈉	4%	-	3%	-
月桂基硫酸鈉	2%	3%	-	4%
二異丁基萘磺酸鈉	-	6%	5%	6%
辛酚聚乙二醇醚	-	1%	2%	-
(7-8 莫耳之環氧乙烷)				
高分散性矽酸	1%	3%	5%	10%
高嶺土	88%	62%	35%	-

將活性成分與佐劑徹底混合及將混合物在適合的磨碎機中徹底研磨，得到可濕性粉劑，其可以水稀釋，得到任何所欲濃度的懸浮劑。

<u>F4.包膜顆粒</u>	a)	b)	c)
活性成分	0.1%	5%	15%
高分散性矽酸	0.9%	2%	2%
無機載劑	99.0%	93%	83%

(直徑 0.1-1 毫米)，例如 CaCO₃ 或 SiO₂

將活性成分溶解在二氯甲烷中，將溶液噴霧在載劑上

及接著將溶劑在真空中蒸發。

<u>F5.包膜顆粒</u>	a)	b)	c)
活性成分	0.1%	5%	15%
聚乙二醇 MW 200	1.0%	2%	3%
高分散性矽酸	0.9%	1%	2%
無機載劑	98.0%	92%	80%

(直徑 0.1-1 毫米)，例如 CaCO_3 或 SiO_2

將細研磨之活性成分在混合器中均勻地塗覆於以聚乙二醇弄濕的載劑上。以該方式獲得無粉塵之包膜顆粒。

<u>F6.擠壓器顆粒</u>	a)	b)	c)	d)
活性成分	0.1%	3%	5%	15%
木質磺酸鈉	1.5%	2%	3%	4%
羧甲基纖維素	1.4%	2%	2%	2%
高嶺土	97.0%	93%	90%	79%

將活性成分與佐劑混合及研磨，並將混合物以水弄濕。
將所得混合物擠壓及接著在空氣流中乾燥。

<u>F7.粉劑</u>	a)	b)	c)
活性成分	0.1%	1%	5%
滑石	39.9%	49%	35%
高嶺土	60.0%	50%	60%

即用型粉劑係藉由將活性成分與載劑混合及在適合的磨碎機中研磨混合物而獲得。

<u>F8.懸浮濃縮劑</u>	a)	b)	c)	d)
活性成分	3%	10%	25%	50%

乙二醇	5%	5%	5%	5%
辛酚聚乙二醇醚	-	1%	2%	-
(15 莫耳之環氧乙烷)				
木質磺酸鈉	3%	3%	4%	5%
羧甲基纖維素	1%	1%	1%	1%
37% 甲醛水溶液	0.2%	0.2%	0.2%	0.2%
聚矽氧油乳液	0.8%	0.8%	0.8%	0.8%
水	87%	79%	62%	38%

將細研磨之活性成分與佐劑緊密混合，得到懸浮濃縮劑，可藉由以水稀釋而從該濃縮劑製備任何所欲濃度之懸浮劑。

本發明也關於一種選擇性控制在有用植物之農作物中的禾草及雜草之方法，其包含以式 I 化合物處理有用植物或在栽種下的面積或其所在地。

其中可使用根據本發明的組成物的有用植物之農作物包括穀類、棉、大豆、甜菜、甘蔗、農園作物、油菜、粟米及稻米，及用於非選擇性雜草控制。根據本發明的組成物特別有用於選擇性控制在穀類、粟米及稻米中的禾草及雜草控制，尤其在稻米中。應瞭解術語“農作物”也包括由於習知的繁殖或基因工程方法而成為耐受於除草劑或除草劑類別（例如，ALS、GS、EPSPS、PPO、ACCase 及 HPPD 抑制劑）之農作物。已藉由習知的繁殖方法而成為耐受於例如咪唑啉酮，如甲氧咪草煙（imazamox）之農作物的實例為 Clearfield® 夏日油菜（Canola）。已藉由基因工程方

法而成為耐受於除草劑之農作物的實例包括例如抗嘉磷塞 (glyphosate) 及抗固殺草 (glufosinate) 之粟米變種，其以商標名稱 RoundupReady®及 LibertyLink®可於市場上取得。欲控制之雜草可為單子葉及雙子葉雜草二者，如例繁縷屬 (Stellaria)、豆瓣菜屬 (Nasturtium)、剪股穎屬 (Agrostis)、馬唐屬 (Digitaria)、燕麥屬 (Avena)、狗尾草屬 (Setaria)、白芥屬 (Sinapis)、黑麥草屬 (Lolium)、茄屬 (Solanum)、稗屬 (Echinochloa)、蔗草屬 (Scirpus)、兩久花屬 (Monochoria)、慈姑屬 (Sagittaria)、麥屬 (Bromus)、看麥娘屬 (Alopecurus)、蜀黍屬 (Sorghum)、羅氏草屬 (Rottboellia)、莎草屬 (Cyperus)、白麻屬 (Abutilon)、黃花稔屬 (Sida)、蒼耳屬 (Xanthium)、莧屬 (Amaranthus)、藜屬 (Chenopodium)、番薯屬 (Ipomoea)、菊屬 (Chrysanthemum)、豬殃殃屬 (Galium)、堇菜屬 (Viola) 及婆婆納屬 (Veronica)。

也應瞭解農作物為那些藉由基因工程法而成為對抗有害昆蟲的農作物，例如，Bt 粟米 (對抗歐洲玉米螟 (corn borer))、Bt 棉 (對抗棉鈴象鼻蟲 (boll weevil)) 及也為 Bt 馬鈴薯 (對抗科羅拉多甲蟲 (Colorado beetle))。Bt 粟米的實例為 NK®之 Bt-176 粟米混種 (Syngenta Seeds)。Bt 毒素為蘇力菌 (Bacillus thuringiensis) 土壤細菌天然形成的蛋白質。毒素及能夠合成該等毒素之轉基因植物的實例被敘述在 EP-A-451 878、EP-A-374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、WO 03/052073 及 EP-A-427 529

中。包括編碼昆蟲抗性及表現一或多種毒素的一或多種基因的轉基因植物的實例為 KnockOut®(粟米)、Yield Gard®(粟米)、NuCOTIN33B®(棉)、Bollgard®(棉)、NewLeaf®(馬鈴薯)、NatureGard®及 Protexcta®。植物農作物及彼之種子材料可對抗除草劑，且同時也可對抗昆蟲取食(“堆疊式”轉基因品項)。種子可以，例如，具有表現殺昆蟲活性 Cry3 蛋白的能力，且同時耐受於嘉磷塞。應瞭解術語“農作物”也包括由於的習知的繁殖或基因工程方法，包括又稱為出產特性的方法(例如，經改進之氣味、貯存穩定性、營養素含量)所獲得的農作物。

應瞭解在栽種下的面積包括農作植物已生長之土地與意圖栽種該等農作植物的土地。

根據本發明的式 I 化合物也可與其他的除草劑組合使用。式 I 化合物的下列混合物尤其重要。較佳地，在這些混合物中，式 I 化合物為那些在下列表 1 至 294 中所列之化合物中之一：

式 I 化合物 + 乙草胺 (acetochlor)、式 I 化合物 + 三氟羧草醚 (acifluorfen)、式 I 化合物 + 三氟羧草醚-鈉、式 I 化合物 + 苯草醚 (aclonifen)、式 I 化合物 + 丙烯醛 (acrolein)、式 I 化合物 + 拉草 (alachlor)、式 I 化合物 + 枯殺達 (alloxydim)、式 I 化合物 + 烯丙醇、式 I 化合物 + 草殺淨 (ametryn)、式 I 化合物 + 胺唑草酮 (amicarbazone)、式 I 化合物 + 磺胺磺隆 (amidosulfuron)、式 I 化合物 + 二氯胺基吡啶酸 (aminopyralid)、式 I 化合

物 + 阿米托 (amitrole)、式 I 化合物 + 胺基磺酸銨、式 I
 化合物 + 莎稗磷(anilofos)、式 I 化合物 + 亞速爛(asulam)、
 式 I 化合物 + 草脫淨(atrazine)、式 I 化合物 + 艾維激素
 (aviglycine)、式 I 化合物 + 草芬定(azafenidin)、式 I
 化合物 + 阿日姆沙風(azimsulfurone)、式 I 化合物 + BCPC、
 式 I 化合物 + 畢氟布它密德(beflubutamid)、式 I 化合物
 + 草除靈(benazolin)、式 I 化合物 + 倍卡貝容
 (bencarbazon)、式 I 化合物 + 倍尼芬(benfluralin)、
 式 I 化合物 + 倍氟沙特(benfuresate)、式 I 化合物 + 免
 速隆(bensulfuron)、式 I 化合物 + 免速隆-甲基、式 I 化
 合物 + 地散磷(bensulide)、式 I 化合物 + 滅草松
 (bentazone)、式 I 化合物 + 雙苯嘧草酮(benzfendizone)、
 式 I 化合物 + 倍柔畢塞隆(benzobicyclon)、式 I 化合物
 + 倍柔分奈普(benzofenap)、式 I 化合物 + 必芬諾
 (bifenox)、式 I 化合物 + 雙丙胺磷(bilanafos)、式 I
 化合物 + 雙草醚(bispyribac)、式 I 化合物 + 雙草醚-鈉、
 式 I 化合物 + 硼砂(borax)、式 I 化合物 + 克草(bromacil)、
 式 I 化合物 + 溴丁草胺(bromobutide)、式 I 化合物 + 溴
 分諾希姆(bromofenoxim)、式 I 化合物 + 溴苯亞硝酸鹽
 (bromoxynil)、式 I 化合物 + 丁基拉草(butachlor)、
 式 I 化合物 + 布它分奈希爾(butafenacil)、式 I 化合物 +
 布它密服斯(butamifos)、式 I 化合物 + 丁樂靈(butralin)、
 式 I 化合物 + 布托西定(butroxydim)、式 I 化合物 + 丁草
 特(butylate)、式 I 化合物 + 二甲基膦酸(cacodylic acid)、

式 I 化合物 + 氯酸鈣、式 I 化合物 + 凱分司托爾
 (cafenstrole)、式 I 化合物 + 雙醯草胺 (carbetamide)、
 式 I 化合物 + 克繁草 (carfentrazone)、式 I 化合物 + 克繁
 草-乙基、式 I 化合物 + CDEA、式 I 化合物 + CEPC、式 I
 化合物 + 整形醇 (chlorflurenol)、式 I 化合物 + 整形醇-
 甲基、式 I 化合物 + 克洛達柔 (chloridazon)、式 I 化合
 物 + 氯嘧磺隆 (chlorimuron)、式 I 化合物 + 氯嘧磺隆-乙
 基、式 I 化合物 + 氯基乙酸、式 I 化合物 + 綠麥隆
 (chlorotoluron)、式 I 化合物 + 氯苯胺靈 (chlorpropham)、
 式 I 化合物 + 綠磺隆 (chlorsulfuron)、式 I 化合物 + 二甲
 基氯酞酸 (chlorthal)、式 I 化合物 + 二甲基氯酞酸-二甲
 基、式 I 化合物 + 吲哚酮草酯 (cinidon)-乙基、式 I 化合
 物 + 環庚草醚 (cinmethylin)、式 I 化合物 + 西速隆
 (cinosulfuron)、式 I 化合物 + 咯草隆 (cisanilide)、式
 I 化合物 + 剋草同 (clethodim)、式 I 化合物 + 可洛丁那
 福普 (clodinafop)、式 I 化合物 + 可洛丁那福普-丙炔基、
 式 I 化合物 + 異惡草酮 (Clomazone)、式 I 化合物 + 克普
 草 (clomeprop)、式 I 化合物 + 畢克草 (clopyralid)、式
 I 化合物 + 可洛拉蘇蘭 (cloransulam)、式 I 化合物 + 可
 洛拉蘇蘭-甲基、式 I 化合物 + CMA、式 I 化合物 + 4-CPB、
 式 I 化合物 + CPMF、式 I 化合物 + 4-CPP、式 I 化合物 +
 CPPC、式 I 化合物 + 甲酚、式 I 化合物 + 庫密路若
 (cumyluron)、式 I 化合物 + 氰胺 (cyanamide)、式 I 化
 合物 + 氰乃淨 (cyanazine)、式 I 化合物 + 環草特

(cycloate)、式 I 化合物 + 環丙嘧磺隆(cyclosulfamuron)、式 I 化合物 + 環殺草(cycloxydim)、式 I 化合物 + 賽伏草(cyhalofop)、式 I 化合物 + 賽伏草-丁基、式 I 化合物 + 2,4-D、式 I 化合物 + 3,4-DA、式 I 化合物 + 殺草隆(daimuron)、式 I 化合物 + 得拉本(dalapon)、式 I 化合物 + 邁隆(dazomet)、式 I 化合物 + 2,4-DB、式 I 化合物 + 3,4-DB、式 I 化合物 + 2,4-DEB、式 I 化合物 + 甜菜安(desmedipham)、式 I 化合物 + 狄斯密退恩(desmetryn)、式 I 化合物 + 殺草畏(dicamba)、式 I 化合物 + 二氯苯晴(dichlobenil)、式 I 化合物 + 鄰-二氯苯、式 I 化合物 + 對-二氯苯、式 I 化合物 + 滴丙酸(dichlorprop)、式 I 化合物 + 滴丙酸-P、式 I 化合物 + 禾草靈(diclofop)、式 I 化合物 + 禾草靈-甲基、式 I 化合物 + 雙氯磺草胺(diclosulam)、式 I 化合物 + 野燕枯(difenzoquat)、式 I 化合物 + 甲硫野燕枯(difenzoquat-metilsulfate)、式 I 化合物 + 毗吡草胺(diflufenican)、式 I 化合物 + 狄氟陸分柔皮(diflufenzopyr)、式 I 化合物 + 惡唑隆(dimefuron)、式 I 化合物 + 哌草丹(dimepiperate)、式 I 化合物 + 狄麥賽可樂(dimethachlor)、式 I 化合物 + 狄麥賽密退恩(dimethametryn)、式 I 化合物 + 汰草滅(dimethenamid)、式 I 化合物 + 汰草滅-P、式 I 化合物 + 穫萎得(dimethipin)、式 I 化合物 + 二甲基肼酸、式 I 化合物 + 撻乃安(dinitramine)、式 I 化合物 + 狄諾特伯(dinoterb)、式 I 化合物 + 大芬滅(diphenamid)、式 I 化合物 + 異丙淨

(dipropetryn)、式 I 化合物 + 敵草快 (diquat)、式 I 化合物 + 敵草快二溴化物、式 I 化合物 + 汰硫草 (dithiopyr)、式 I 化合物 + 達有龍 (diuron)、式 I 化合物 + DNOC、式 I 化合物 + 3,4-DP、式 I 化合物 + DSMA、式 I 化合物 + EBEP、式 I 化合物 + 草多索 (endothal)、式 I 化合物 + EPTC、式 I 化合物 + 抑死夫 (esprocarb)、式 I 化合物 + 伊賽氟拉林 (ethalfluralin)、式 I 化合物 + 胺苯磺隆 (ethametsulfuron)、式 I 化合物 + 胺苯磺隆-甲基、式 I 化合物 + 益收生長素 (ethephon)、式 I 化合物 + 益覆滅 (ethofumesate)、式 I 化合物 + 氯氟苯醚 (ethoxyfen)、式 I 化合物 + 亞速隆 (ethoxysulfuron)、式 I 化合物 + 伊托班尚尼德 (etobenzanid)、式 I 化合物 + 芬殺草 (fenoxaprop)-P、式 I 化合物 + 芬殺草-P-乙基、式 I 化合物 + 四唑草胺 (fentrazamide)、式 I 化合物 + 硫酸亞鐵、式 I 化合物 + 氟燕靈 (flamprop)-M、式 I 化合物 + 伏速隆 (flazasulfuron)、式 I 化合物 + 麥喜為 (florasulam)、式 I 化合物 + 伏寄普 (fluazifop)、式 I 化合物 + 伏寄普-丁基、式 I 化合物 + 伏寄普-P、式 I 化合物 + 伏寄普-P-丁基、式 I 化合物 + 異丙吡草酯 (fluazolate)、式 I 化合物 + 氟酮磺隆 (flucarbazone)、式 I 化合物 + 氟酮磺隆-鈉、式 I 化合物 + 氟啶乙磺隆 (flucetosulfuron)、式 I 化合物 + 氟消草 (fluchloralin)、式 I 化合物 + 氟噻草胺 (flufenacet)、式 I 化合物 + 氟噻嗪草酯 (flufenpyr)、式 I 化合物 + 氟噻嗪草酯-乙基、式 I 化合物 + 氟節胺

(flumetralin) 、式 I 化合物 + 氟滅索倫 (flumetsulam) 、
 式 I 化合物 + 氟米克拉 (flumiclorac) 、式 I 化合物 + 氟
 米克拉-戊基、式 I 化合物 + 氟米沙立 (flumioxazin) 、式
 I 化合物 + 氟米羅必 (flumipropin) 、式 I 化合物 + 伏草隆
 (fluometuron) 、式 I 化合物 + 氟羅格賴可芬
 (fluoroglycofen) 、式 I 化合物 + 氟羅格賴可芬-乙基、式
 I 化合物 + 氟杉普 (fluoxaprop) 、式 I 化合物 + 弗拉頗沙
 (flupoxam) 、式 I 化合物 + 氟普帕希耳 (flupropacil) 、
 式 I 化合物 + 氟普洛奈特 (fluproanate) 、式 I 化合物 +
 氟啞嘧磺隆 (flupyrsulfuron) 、式 I 化合物 + 氟啞嘧磺隆-
 甲基-鈉、式 I 化合物 + 茚丁酯 (flurenol) 、式 I 化合物 +
 氟立得酮 (fluridone) 、式 I 化合物 + 氟氯得酮
 (flurochloridone) 、式 I 化合物 + 氟氯比 (fluroxypyr) 、
 式 I 化合物 + 呋草酮 (flurtamone) 、式 I 化合物 + 氟噻乙
 草酯 (fluthiacet) 、式 I 化合物 + 氟噻乙草酯-甲基、式 I
 化合物 + 福美沙芬 (fomesafen) 、式 I 化合物 + 噻胺磺隆
 (foramsulfuron) 、式 I 化合物 + 福殺胺 (fosamine) 、
 式 I 化合物 + 固殺草 (glufosinate) 、式 I 化合物 + 固殺草
 -銨、式 I 化合物 + 嘉磷塞 (glyphosate) 、式 I 化合物 +
 鹵殺福隆 (halosulfuron) 、式 I 化合物 + 鹵殺福隆-甲基、
 式 I 化合物 + 鹵斯弗 (haloxyfop) 、式 I 化合物 + 鹵斯弗-
 P、式 I 化合物 + HC-252、式 I 化合物 + 環己基二甲胺基甲
 基三吡二酮 (hexazinone) 、式 I 化合物 + 依馬扎沙苯
 (imazamethabenz) 、式 I 化合物 + 依馬扎沙苯-甲基、式

I 化合物 + 甲氧咪草煙 (imazamox)、式 I 化合物 + 甲咪唑煙酸 (imazapic)、式 I 化合物 + 依滅草 (imazapyr)、式 I 化合物 + 嗎紫奎 (imazaquin)、式 I 化合物 + 嗎茲紫比 (imazethapyr)、式 I 化合物 + 嗎殺福隆 (imazosulfuron)、式 I 化合物 + 節草酮 (indanofan)、式 I 化合物 + 碘基甲烷、式 I 化合物 + 碘甲磺隆 (iodosulfuron)、式 I 化合物 + 碘甲磺隆 - 甲基 - 鈉、式 I 化合物 + 碘苯亞硝酸鹽 (ioxynil)、式 I 化合物 + 異丙土隆 (isoproturon)、式 I 化合物 + 依索隆 (isouron)、式 I 化合物 + 依索苯 (isoxaben)、式 I 化合物 + 異𠵼氯托 (isoxachlortole)、式 I 化合物 + 異𠵼氯草 (isoxaflutole)、式 I 化合物 + 依索比立福 (isoxapyrifop)、式 I 化合物 + 卡靈草 (karbutilate)、式 I 化合物 + 累托芬 (lactofen)、式 I 化合物 + 環草定 (lenacil)、式 I 化合物 + 利倫 (linuron)、式 I 化合物 + MAA、式 I 化合物 + MAMA、式 I 化合物 + MCPA、式 I 化合物 + MCPA-硫乙基、式 I 化合物 + MCPB、式 I 化合物 + 甲氯丙酸 (mecoprop)、式 I 化合物 + 甲氯丙酸-P、式 I 化合物 + 美芬司特 (mefenacet)、式 I 化合物 + 氟草磺 (mefluidid)、式 I 化合物 + 磺胺磺隆 (mesosulfuron)、式 I 化合物 + 磺胺磺隆-甲基、式 I 化合物 + 甲基磺草酮 (mesotrione)、式 I 化合物 + 米塔姆 (metam)、式 I 化合物 + 𠵼唑醯草胺 (metamifop)、式 I 化合物 + 滅得群 (metamitron)、式 I 化合物 + 美他佐克羅 (metazachlor)、式 I 化合物 + 甲基苯噻隆

(methabenzthiazuron)、式 I 化合物 + 滅草唑(methazole)、
 式 I 化合物 + 甲基肼酸、式 I 化合物 + 甲基代隆
 (methyldymron)、式 I 化合物 + 異硫代氰酸甲酯、式 I
 化合物 + 美他苯隆 (metabenzuron)、式 I 化合物 + 秀谷
 隆(metobromuron)、式 I 化合物 + 美托克羅(metolachlor)、
 式 I 化合物 + S-美托克羅、式 I 化合物 + 美托沙泣
 (metosulam)、式 I 化合物 + 美托斯隆 (metoxuron)、
 式 I 化合物 + 賽克津 (metribuzin)、式 I 化合物 + 美殺福
 隆 (metsulfuron)、式 I 化合物 + 美殺福隆-甲基、式 I 化
 合物 + MK-616、式 I 化合物 + 莫立那特 (molinate)、式 I
 化合物 + 莫那立得 (monalide)、式 I 化合物 + MSMA、
 式 I 化合物 + 那普苯胺 (naproanilide)、式 I 化合物 + 那
 普醯胺 (napropamide)、式 I 化合物 + 抑草生 (naptalam)、
 式 I 化合物 + NDA-402989、式 I 化合物 + 草不隆(neburon)、
 式 I 化合物 + 尼可殺福隆 (nicosulfuron)、式 I 化合物 +
 尼比拉西芬 (nipyraciophen)、式 I 化合物 + 正-甲基嘉磷
 塞、式 I 化合物 + 壬酸、式 I 化合物 + 達草滅(norflurazon)、
 式 I 化合物 + 油酸 (脂肪酸)、式 I 化合物 + 奧貝卡
 (orbencarb)、式 I 化合物 + 歐索磺目洛(othosulfamuron)、
 式 I 化合物 + 黃草消 (oryzalin)、式 I 化合物 + 奧沙地奇
 (oxadiargyl)、式 I 化合物 + 惡草靈 (oxadiazon)、式 I
 化合物 + 環氧嘧磺隆 (oxasulfuron)、式 I 化合物 + 噁嗪
 草酮 (oxaziclomefone)、式 I 化合物 + 奧氟芬
 (oxyfluorfen)、式 I 化合物 + 巴拉刈 (paraquat)、式 I

化合物 + 巴拉刈二氯化物、式 I 化合物 + 克草敵 (pebulate)、式 I 化合物 + 培那西林 (pendimethalin)、式 I 化合物 + 磺醯脲 (penoxulam)、式 I 化合物 + 五氯酚、式 I 化合物 + 甲氯草胺 (pentanochlor)、式 I 化合物 + 環戊氧草酮 (pentoxazone)、式 I 化合物 + 烯草胺 (pethoxamid)、式 I 化合物 + 石油、式 I 化合物 + 甜菜寧 (phenmedipham)、式 I 化合物 + 甜菜寧-乙基、式 I 化合物 + 毒莠定 (picloram)、式 I 化合物 + 吡氟酰草胺 (picolinafen)、式 I 化合物 + 吡諾山登 (pinoxaden)、式 I 化合物 + 派羅福 (piperophos)、式 I 化合物 + 亞膦酸鉀、式 I 化合物 + 疊氮化鉀、式 I 化合物 + 普立拉克 (pretilachlor)、式 I 化合物 + 撲滅磺甲酯 (primisulfuron)、式 I 化合物 + 撲滅磺甲酯-甲基、式 I 化合物 + 普魯二胺 (prodiamine)、式 I 化合物 + 普氟唑 (profluazol)、式 I 化合物 + 環苯草酮 (profoxydim)、式 I 化合物 + 調環酸 (prohexadione)-鈣、式 I 化合物 + 撲滅通 (prometon)、式 I 化合物 + 撲草淨 (prometryn)、式 I 化合物 + 毒草安 (propachlor)、式 I 化合物 + 敵稗 (propanil)、式 I 化合物 + 西帕奎 (propaquizafop)、式 I 化合物 + 撲滅津 (propazine)、式 I 化合物 + 苯胺靈 (propham)、式 I 化合物 + 普羅比索克 (propisochlor)、式 I 化合物 + 丙苯磺隆 (propoxycarbazone)、式 I 化合物 + 丙苯磺隆-鈉、式 I 化合物 + 氯甲丙炔基苯甲醯胺 (propyzamide)、式 I 化合物 + 撲沙福卡 (prosulfocarb)、式 I 化合物 + 撲沙殺福隆

(prosulfuron)、式 I 化合物 + 雙唑草腈 (pyraclonil)、式 I 化合物 + 吡草醚 (pyraflufen)、式 I 化合物 + 吡草醚-乙基、式 I 化合物 + 吡拉蘇福托 (pyrasulfotole)、式 I 化合物 + 吡唑林特 (pyrazolinate)、式 I 化合物 + 必拉若殺福隆-乙基 (pyrazosulfuron)、式 I 化合物 + 必拉若殺福隆-乙基、式 I 化合物 + 比拉若西芬 (pyrazoxyfen)、式 I 化合物 + 嘧啶脞草醚 (pyribenzoxim)、式 I 化合物 + 稗草畏 (pyributicarb)、式 I 化合物 + 吡達夫醇 (pyridafol)、式 I 化合物 + 吡達特 (pyridate)、式 I 化合物 + 環酯草醚 (pyriftalid)、式 I 化合物 + 吡嘧多巴克 (pyrimidobac)、式 I 化合物 + 吡嘧多巴克-甲基、式 I 化合物 + 吡嘧蘇發 (pyrimisulfan)、式 I 化合物 + 比立塞巴克 (pyrithiobac)、式 I 化合物 + 比立塞巴克-鈉、式 I 化合物 + 吡洛山蘇風 (pyroxasulfone) (KIH-485)、式 I 化合物 + 吡洛殊蘭 (pyroxulam)、式 I 化合物 + 昆多拉克 (quindorac)、式 I 化合物 + 昆美拉克 (quinmerac)、式 I 化合物 + 滅藻 (quinoclamine)、式 I 化合物 + 奎拉弗 (quizalofop)、式 I 化合物 + 奎拉弗-P、式 I 化合物 + 力殺福隆 (rimsulfuron)、式 I 化合物 + 稀禾定 (sethoxydim)、式 I 化合物 + 環草隆 (siduron)、式 I 化合物 + 西瑪三腈 (simazine)、式 I 化合物 + 西草淨 (simetryn)、式 I 化合物 + SMA、式 I 化合物 + 亞肼酸鈉、式 I 化合物 + 疊氮化鈉、式 I 化合物 + 氯酸鈉、式 I 化合物 + 磺草酮 (sulcotrione)、式 I 化合物 + 沙芬曲諾 (sulfentrazone)、

式 I 化合物 + 殺福美隆 (sulfometuron)、式 I 化合物 + 殺福美隆-甲基、式 I 化合物 + 沙弗司特 (sulfosate)、式 I 化合物 + 磺醢磺隆 (sulfosulfuron)、式 I 化合物 + 硫酸、式 I 化合物 + 焦油、式 I 化合物 + 2,3,6-TBA、式 I 化合物 + TCA、式 I 化合物 + TCA-鈉、式 I 化合物 + 替布他 (tebutam)、式 I 化合物 + 替布塞隆 (tebuthiuron)、式 I 化合物 + 替呋退酮 (tefuryltrione)、式 I 化合物 + 提波退酮 (tembotrione)、式 I 化合物 + 得殺草 (tepraloxym)、式 I 化合物 + 特草定 (terbacil)、式 I 化合物 + 甲氧去草淨 (terbumeton)、式 I 化合物 + 特丁津 (terbuthylazine)、式 I 化合物 + 去草淨 (terbutryn)、式 I 化合物 + 西尼克羅 (thenylchlor)、式 I 化合物 + 噻殺福隆 (thiazafluron)、式 I 化合物 + 噻諾比 (thiazopyr)、式 I 化合物 + 噻吩殺福隆 (thifensulfuron)、式 I 化合物 + 噻卡倍容 (thiencarbazone)、式 I 化合物 + 噻吩殺福隆-甲基、式 I 化合物 + 噻歐苯卡 (thiobencarb)、式 I 化合物 + 替歐卡巴力 (tiocarbazil)、式 I 化合物 + 托普米容 (topramezone)、式 I 化合物 + 曲考昔地 (tralkoxydim)、式 I 化合物 + 野麥畏 (triallate)、式 I 化合物 + 三阿蘇殺福隆 (triasulfuron)、式 I 化合物 + 三吡氟草胺 (triaziflam)、式 I 化合物 + 三苯那隆 (tribenuron)、式 I 化合物 + 三苯那隆-甲基、式 I 化合物 + 殺草畏 (tricamba)、式 I 化合物 + 定草酯 (triclopyr)、式 I 化合物 + 草達津 (trietazine)、式 I 化合物 + 三氟氧殺福隆 (trifloxysulfuron)、式 I 化合物 +

三氟氧殺福隆-鈉、式 I 化合物 + 氟樂靈 (trifluralin)、式 I 化合物 + 三氟殺福隆 (triflusulfuron)、式 I 化合物 + 三氟殺福隆-甲基、式 I 化合物 + 三羥基三吡、式 I 化合物 + 抗倒酯 (trinexapac) - 乙基、式 I 化合物 + 三氟甲磺隆 (tritosulfuron)、式 I 化合物 + [3-[2-氯基-4-氟基-5-(1-甲基-6-三氟甲基-2,4-二酮-1,2,3,4-四氫嘧啶-3-基)苯氧基]-2-吡啶氧基]乙酸乙酯 (CAS RN 353292-31-6)、式 I 化合物 + 4-羥基-3-[[2-[(2-甲氧基乙氧基)甲基]-6-(三氟甲基)-3-吡啶基]羰基]雙環[3.2.1]辛-3-烯-2-酮 (CAS RN 372010-68-5)、式 I 化合物 + 2-氯基-5-[3,6-二氫-3-甲基-2,6-二酮基-4-(三氟甲基)-1(2H)-嘧啶基]-4-氟基-N-[[甲基(1-甲乙基)胺基]磺醯基]苯甲醯胺 (CAS RN 372137-35-4) 及式 I 化合物 + 4-羥基-3-[[2-(3-甲氧基丙基)-6-(二氟甲基)-3-吡啶基]羰基]雙環[3.2.1]辛-3-烯-2-酮。

式 I 化合物的混合伙伴也可具有酯類或鹽類形式，如例在 2000 年的第 12 版殺蟲劑手冊 (The Pesticide Manual) (BCPC) 中所說明者。

根據本發明的式(I)化合物也可與安全劑組合使用。較佳地，在這些混合物中，式(I)化合物為那些在下列表 1 至 294 中所列之化合物中之一。尤其考慮下列的具有安全劑的混合物：

式(I)化合物 + 解毒啞 (cloquintocet-methyl)、式(I)化合物 + 解毒啞酸及其酯、式(I)化合物 + 解草啞 (fenchlorazole-ethyl)、式(I)化合物 + 解草啞酸及其酯、

式(I)化合物 + 吡唑解草酯 (mefenpyr-diethyl)、式(I)化合物 + 吡唑解草酯二酸、式(I)化合物 + 雙苯噁唑酸 (isoxadifen-ethyl)、式(I)化合物 + 雙苯噁唑酸 (isoxadifen-acid)、式(I)化合物 + 解草噁唑 (furilazole)、式(I)化合物 + 解草噁唑 R 異構物、式(I)化合物 + 解草嗪 (benoxacor)、式(I)化合物 + 二氯丙烯胺 (dichlormid)、式(I)化合物 + AD-67、式(I)化合物 + 解草腈 (oxabetrinil)、式(I)化合物 + 解草胺腈 (cyometrinil)、式(I)化合物 + 解草胺腈 Z-異構物、式(I)化合物 + 解草啉 (fencloirim)、式(I)化合物 + 賽普蘇法麥得 (cyprosulfamide)、式(I)化合物 + 茶酸酐、式(I)化合物 + 解草安 (flurazole)、式(I)化合物 + N-(2-甲氧基苯甲醯基)-4-[(甲胺基羰基)胺基]苯磺醯胺、式(I)化合物 + CL 304,415、式(I)化合物 + 二賽可羅諾 (dicyclonon)、式(I)化合物 + 氟草肟 (fluxofenim)、式(I)化合物 + DKA-24、式(I)化合物 + R-29148 及式(I)化合物 + PPG-1292。安全化效果也可於式(I)化合物 + 汰草龍 (dymron)、式(I)化合物 + MCPA、式(I)化合物 + 米可迫普 (mecoprop) 及式(I)化合物 + 米可迫普-P 之混合物而觀察到。

上述安全劑及除草劑被述敘在，例如，英國農作物保護委員會 (British Crop Protection Council) 於 2000 年的第 12 版殺蟲劑手冊中。R-29148 係由例如 P. B. Goldsbrough 等人於 Plant Physiology, (2002), Vol. 130, pp. 1497-1505 與其中的參考文獻所敘述。PPG-1292 係從 WO09211761 已

知及 N-(2-甲氧基苯甲醯基)-4-[(甲胺基羰基)胺基]苯磺醯胺係從 EP365484 已知。

除了含有式 I 化合物之外，根據本發明較佳的組成物包括另外的除草劑作為混合伙伴及安全劑。

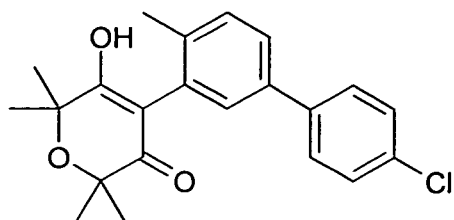
下列的實施例進一步說明本發明，但不是限制本發明。

那些熟習所屬技術領域者將理解下述的某些化合物為 β -酮烯類，並照其原樣子可以單一互變異構物或以酮基-烯醇與二酮互變異構物之混合物存在，如例由 J. March 於 John Wiley and Sons 的第 3 版 Advanced Organic Chemistry 所述。在下列及於表 T1 與 P1 中所示之化合物係以任意的單一烯醇互變異構物所描繪，但是應做出該說明涵蓋二酮型式及可經由互變異構現象引起的任何可能的烯醇二者的推斷。而且，一些下列及於表 A、表 B、表 C 和表 D 中所示之化合物係以簡化為目的的單一互變異構物所描繪，但是除非指定為單一互變異構物，這些結構應被理解為代表鏡像異構物之混合物。另外，一些化合物可以非鏡像異構物存在，並且應做出這些化合物可以非鏡像異構物之混合物或任何可能的單一鏡像異構物存在。在詳細的實驗章節之內，二酮互變異構物係以命名為目的而選擇，即使主要的互變異構物為烯醇型式。

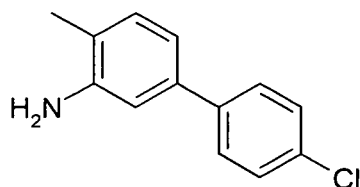
【實施方式】

製備實施例：

實施例 1：4-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡

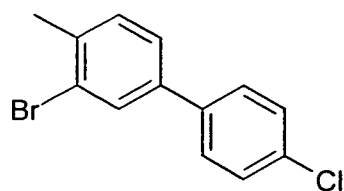
喃-3,5-二酮之製備

步驟 1：3-胺基-4'-氯基-4-甲基聯苯之製備



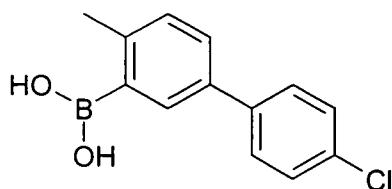
將肆(三苯膦)鉀(0) (3.7 公克, 0.003 莫耳) 及 4-氯苯基硼酸 (20.2 公克, 0.13 莫耳) 加入在 1,2-二甲氧基乙烷 (200 毫升) 中的 5-溴基-2-甲基苯胺 (20 公克, 0.1 莫耳) 之溶液中。在將反應混合物在 20°C 下攪拌 15 分鐘之後, 將 20% 之碳酸鈉水溶液 (300 毫升) 加入混合物中, 並將所得混合物在回流下加熱 24 小時。將反應混合物冷卻至室溫, 以水 (600 毫升) 稀釋及使用乙酸乙酯萃取。將合併的有機萃取物經無水硫酸鈉乾燥, 過濾及將過濾物在真空中蒸發。將殘餘物在矽膠上以在己烷中的 70% 乙酸乙酯溶離之管柱層析法進一步純化, 得到 3-胺基-4'-氯基-4-甲基聯苯 (21.0 公克)。

步驟 2：3-溴基-4'-氯基-4-甲基聯苯之製備



將氫溴酸（在水中的 48 重量％之溶液，120 毫升）逐滴加入在水（80 毫升）中的 3-氨基-4'-氯基-4-甲基聯苯（21 公克，0.09 莫耳）之懸浮液中，並將混合物攪拌，直到溶解為止。將混合物冷卻至 -5°C 及逐滴加入在水（50 毫升）中的亞硝酸鈉（10.12 公克，0.14 莫耳）之溶液，使溫度維持在 $0-5^{\circ}\text{C}$ 。將反應混合物攪拌 1 小時，接著在 0°C 下加入在氫溴酸（在水中的 48 重量％之溶液，120 毫升）中的溴化亞銅（17.9 公克，0.12 莫耳）之預冷卻溶液中。將反應混合物攪拌及允許溫熱至室溫隔夜。將混合物以乙酸乙酯萃取，並將有機萃取物合併，經無水硫酸鈉乾燥，過濾及將過濾物在真空中濃縮。將殘餘物在矽膠上以在己烷中的 2% 乙酸乙酯溶離之管柱層析法進一步純化，得到 3-溴基-4'-氯基-4-甲基聯苯（15.0 公克）。

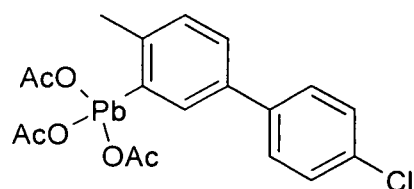
步驟 3：4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基硼酸之製備



將 3-溴基-4'-氯基-4-甲基聯苯（5.0 公克，0.02 莫耳）溶解在無水四氫呋喃（125 毫升）中及將混合物冷卻至 -78

°C。經 30 分鐘逐滴加入正-丁基鋰（在己烷中的 1.33 莫耳之溶液，17.3 毫升），使溫度維持在約 -78°C。將反應混合物在 -78°C 下攪拌 1.5 小時，接著逐滴加入硼酸三甲酯（2.58 公克，0.024 莫耳）及將反應混合物攪拌 3.5 小時，允許其溫熱至 0°C。接著逐滴加入 2N 氫氯酸水溶液（50 毫升），並在一經加完時，將混合物攪拌 2 小時。將混合物在真空中濃縮，移除大部分的四氫呋喃，接著以水（~80 毫升）稀釋及以二乙醚萃取。將有機萃取物合併，經無水硫酸鈉乾燥，過濾及將過濾物在真空中蒸發。將殘餘物在矽膠上以在己烷中的 7% 乙酸乙酯溶離之快速管柱層析法進一步純化，得到 4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基硼酸（2.5 公克）。

步驟 4：三乙酸 4'-氯基-4-甲基聯苯-3-鉛之製備



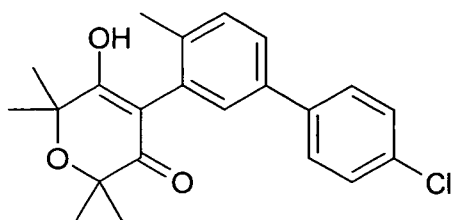
步驟 4a：

將無水氯仿（6 毫升）加入三乙酸鉛（2.44 公克，5.50 毫莫耳）與二乙酸汞（0.16 公克，0.50 毫莫耳）的以氮氣徹底沖洗之混合物中。將該混合物溫熱至 40°C，並加入一份 4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基硼酸（1.23 公克，5.00 毫莫耳），並將懸浮液在該溫度下加熱 5 小時。在冷卻至室溫之後，將混合物濃縮成小體積，接著以己烷研製及過濾，得到粗三乙酸 4'-氯基-4-甲基聯苯-3-鉛（2.93 公克）。

步驟 4b：

將粗三乙酸 4'-氯基-4-甲基聯苯-3-鉛(1.50 公克)溶解在無水氯仿(20 毫升)中，將粉末狀無水碳酸鉀(0.59 公克，4.24 毫莫耳)加入其中，接著快速攪拌 5 分鐘。將固體以過濾移除及將有機溶液濃縮，以供應成為鮮橘色固體的純三乙酸 4'-氯基-4-甲基聯苯-3-鉛(1.121 公克)。

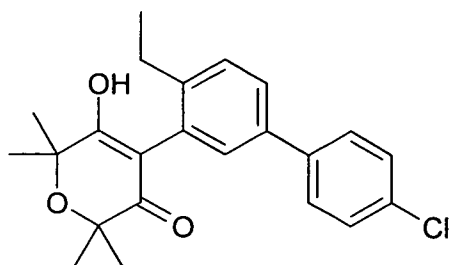
步驟 5：4-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



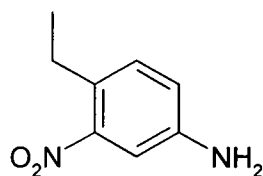
將無水氯仿(20 毫升)加入 2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮(在 US5089046A 中所述)(0.296 公克，1.74 毫莫耳)與 N,N-二甲胺基吡啶(1.06 公克，8.70 毫莫耳)之混合物中，接著在室溫下攪拌，直到溶解為止。將無水甲苯(5 毫升)加入該溶液中，接著加入一份三乙酸 4'-氯基-4-甲基聯苯-3-鉛(1.12 公克，1.91 毫莫耳)及將反應混合物在 80°C 下加熱 1-2 小時。允許混合物冷卻至室溫，接著以二氯甲烷(150 毫升)及稀釋的水性氫氯酸(30 毫升)稀釋，接著攪拌 5 分鐘及經由矽藻土過濾，以移除無機殘餘物(以溶劑額外清洗)。將所有的有機部分合併，經無水硫酸鎂乾燥及在真空中濃縮。將粗產物以管柱層析法(100

% 至 5 : 1 之比的己烷 / 乙酸乙酯) 純化及以己烷研製，以供應成為乳白粉末的 4-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (0.318 公克)。

實施例 2 : 4-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備

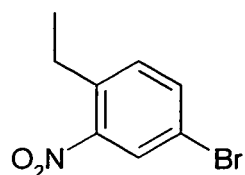


步驟 1 : 4-乙基-3-硝基苯胺之製備



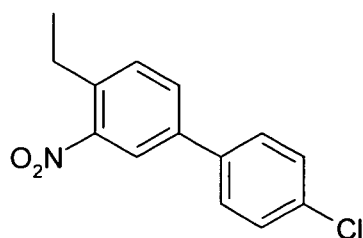
將硝酸銨 (39.6 公克, 0.49 莫耳) 分批加入在濃縮硫酸 (100 毫升) 中的 4-乙基苯胺 (20 公克, 0.16 莫耳) 之冰冷 (冰浴) 溶液中, 使溫度以外部冷卻而維持在 -10° 至 0°C 下。將反應混合物攪拌 2 小時, 接著倒在碎冰上, 並將沉澱物以過濾收集。將固體溶解在水中, 將溶液藉由加入稀釋的氫氧化鈉水溶液而製成中性及以乙酸乙酯萃取。將有機萃取物合併, 經無水硫酸鈉乾燥, 過濾及將過濾物在真空中蒸發, 得到 4-乙基-3-硝基苯胺 (20 公克)。

步驟 2：4-溴基-1-乙基-2-硝基苯之製備



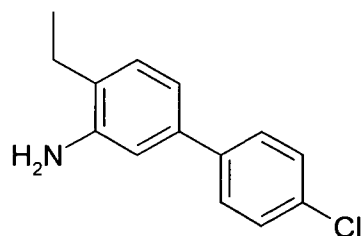
將氫溴酸（在水中的 48 重量 % 之溶液，240 毫升）逐滴加入在水（80 毫升）中的 4-乙基-3-硝基苯胺（20 公克，0.12 莫耳）之懸浮液中，並將混合物攪拌，直到固體溶解為止。將混合物冷卻至 -5°C 及逐滴加入在水（100 毫升）中的亞硝酸鈉（19.8 公克，0.28 莫耳）之溶液，使溫度維持在 $0-5^{\circ}\text{C}$ 。一經加完時，移除冷卻浴及將反應混合物在室溫下攪拌 1 小時。將混合物在 0°C 下逐滴加入在氫溴酸（在水中的 48 重量 %）中的溴化亞銅（22.4 公克，0.16 莫耳）之預冷卻溶液中。將反應混合物攪拌及允許溫熱至室溫經 3 小時。將混合物以二乙醚萃取，並將有機萃取物合併，經無水硫酸鈉乾燥，過濾及將過濾物在真空中濃縮。將殘餘物在矽膠上以己烷溶離之管柱層析法進一步純化，得到 4-溴基-1-乙基-2-硝基苯（18 公克）。

步驟 3：4'-氯基-4-乙基-3-硝基聯苯之製備



將 4-氯苯基硼酸 (14.98 公克, 0.096 莫耳) 及 4-乙基-3-硝基聯苯 (20.0 公克, 0.087 莫耳) 在室溫下加入在 150 毫升 1,2-二甲氧基乙烷中的 4-溴基-1-乙基-2-硝基苯 (20.0 公克, 0.087 莫耳) 中, 並以氮氣起泡流經混合物。在 20 °C 下攪拌 10 分鐘之後, 加入在水 (350 毫升) 中的碳酸鈉 (73.8 公克, 0.696 莫耳) 之溶液及將混合物回流 16 小時。將反應混合物冷卻至室溫, 經由矽藻土過濾, 以 200 毫升乙酸乙酯清洗。將混合物倒入分液漏斗中及將兩相分開。將水相以乙酸乙酯萃取。將有機萃取物合併, 經無水硫酸鎂乾燥, 過濾及將過濾物在真空中蒸發, 得到成為棕色油的 4'-氯基-4-乙基-3-硝基聯苯 (23.84 公克), 以未進一步純化而用於下一步驟中。

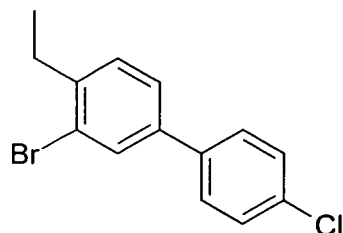
步驟 4: 3-胺基-4'-氯基-4-乙基聯苯之製備



將 4'-氯基-4-乙基-3-硝基聯苯 (22.6 公克, 0.086 莫耳) 懸浮在甲醇 (250 毫升) 中及將反應混合物在室溫下攪拌。加入蒸餾水 (100 毫升), 接著加入鋅粉 (39.0 公克, 0.60 莫耳) 及氯化銨 (13.8 公克, 0.26 莫耳), 並將混合物加熱至回流經 1 小時。將反應混合物冷卻至室溫, 經由矽藻土過濾及將過濾物在真空中蒸發, 以移除大部分

甲醇。將殘餘物分溶在乙酸乙酯（200 毫升）與水之間，並將水相再以乙酸乙酯（200 毫升）萃取。將有機萃取物合併，以水及鹽水清洗，經無水硫酸鎂乾燥，過濾及將過濾物在真空中蒸發，得到成為無色固體的 3-胺基-4'-氯基-4-乙基聯苯（15.0 公克）。該產物係以未進一步純化而直接用於步驟 5 中。

步驟 5：3-溴基-4'-氯基-4-乙基聯苯之製備



步驟 5a：

將 3-胺基-4'-氯基-4-乙基聯苯（60.0 公克，0.26 莫耳）分批加入氫溴酸（在水中的 48 重量％之溶液，350 毫升）與水（250 毫升）之混合物中，並在一經加完時，將混合物加熱至 40°C 及攪拌 20 分鐘，然後在冰浴中冷卻至 5°C。經 45 分鐘逐滴加入在水（100 毫升）中的亞硝酸鈉（20.65 公克，0.30 莫耳）之溶液，並在一經加完時，將混合物在 5°C 下再攪拌 45 分鐘。

步驟 5b：

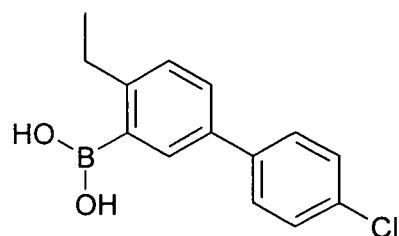
同時，將氫溴酸（在水中的 48 重量％之溶液，400 毫升）在 70°C 下加熱及攪拌，並加入一份硫酸銅五水合物（74.75 公克，0.30 莫耳）及將混合物在 70°C 下攪拌 2 分

鐘，得到深紫色溶液，並接著加入一份銅粉（26.44 公克，0.42 莫耳），得到粉紅色懸浮液。

步驟 5c：

將含有重氮鹽之混合物（在步驟 5a 中所製備）經 70 分鐘分批加入在 70°C 下在步驟 5b 中所製備之攪拌混合物中（在加入含有重氮鹽之混合物期間，在冰浴中維持冷卻）。在一經加完時，將混合物在 70°C 下再攪拌 30 分鐘及接著允許冷卻至室溫，並以乙酸乙酯（3 x 500 毫升）萃取。將有機萃取物合併，以水及鹽水清洗，經無水硫酸鎂乾燥，過濾及將過濾物在真空中蒸發。以在矽膠上的管柱層析法純化，以供應成為黃色油的 3-溴基-4'-氯基-4-乙基聯苯（52.1 公克）。

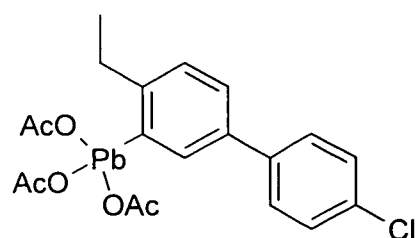
步驟 6：4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基硼酸之製備



將 3-溴基-4'-氯基-4-乙基聯苯（10 公克，0.03 莫耳）溶解在四氫呋喃（250 毫升）中及將溫度冷卻至 -78°C。經 30 分鐘逐滴加入正-丁基鋰（在己烷中的 1.33 莫耳之溶液，34.6 毫升），使溫度維持在約 -78°C。將反應混合物攪拌 1.5 小時，接著逐滴加入硼酸三甲酯（4.9 公克，0.05 莫耳）及將反應混合物攪拌 2 小時。逐滴加入 2N 氫氯酸水溶液

(100 毫升)，並在一經加完時，將混合物攪拌 2 小時。將混合物濃縮，以移除大部分的四氫呋喃，接著以水稀釋及以二乙醚萃取。將有機萃取物以水及鹽水清洗，合併，經無水硫酸鈉乾燥，過濾及將過濾物在真空中蒸發。將殘餘物在矽膠上以在己烷中的 7% 乙酸乙酯溶離之快速管柱層析法進一步純化，得到 4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基硼酸(5.4 公克)。

步驟 7：三乙酸 4'-氯基-4-乙基聯苯-3-鉛之製備



步驟 7a：

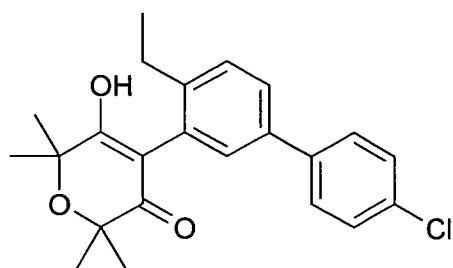
將無水氯仿 (6 毫升) 加入三乙酸鉛 (2.15 公克，4.85 毫莫耳) 與二乙酸汞 (0.15 公克，0.47 毫莫耳) 的以氮氣徹底沖洗之混合物中。將該混合物溫熱至 40°C，並加入一份 4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基硼酸(1.17 公克，4.50 毫莫耳)，並將懸浮液在該溫度下加熱 5 小時。接著將混合物冷卻至室溫，濃縮成小體積，並以己烷研製及過濾，得到粗三乙酸 4'-氯基-4-乙基聯苯-3-鉛(2.70 公克)。

步驟 7b：

將粗三乙酸 4'-氯基-4-乙基聯苯-3-鉛(1.50 公克) 溶解在無水氯仿 (20 毫升) 中，將粉末狀無水碳酸鉀 (0.58 公

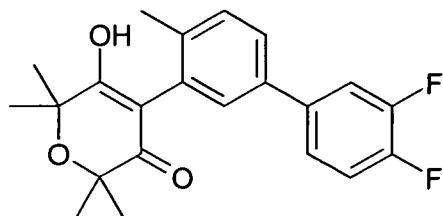
克，4.16 毫莫耳）加入其中，接著快速攪拌 5 分鐘。將固體以過濾移除及將有機溶液濃縮，以供應成為鮮橘色固體的純三乙酸 4'-氯基-4-乙基聯苯-3-鉛(1.176 公克)。

步驟 8：4-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備

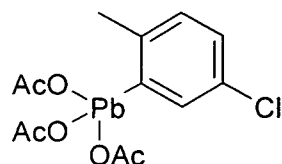


將無水氯仿 (20 毫升) 加入 2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (在 US5089046A 中所述) (0.303 公克，1.78 毫莫耳) 與 N,N-二甲胺基吡啶 (1.09 公克，8.90 毫莫耳) 之混合物中，接著在室溫下攪拌，直到溶解為止。將無水甲苯 (5 毫升) 加入該溶液中，接著加入一份三乙酸 4'-氯基-4-乙基聯苯-3-鉛 (1.17 公克，1.96 毫莫耳) 及將混合物在 80 °C 下加熱 1-2 小時。允許混合物冷卻至室溫，接著以二氯甲烷 (150 毫升) 及稀釋的水性氫氯酸 (30 毫升) 稀釋，接著攪拌 5 分鐘及經由矽藻土過濾，以移除無機殘餘物 (以溶劑額外清洗)。將所有的有機部分合併，經無水硫酸鎂乾燥及在真空中濃縮。將粗產物以管柱層析法 (100% 己烷至 5:1 之比的己烷 / 乙酸乙酯) 純化，接著以己烷研製，以供應成為乳白粉末的 4-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (0.46 公克)。

實施例 3：4-(3',4'-二氟基-4-甲基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備

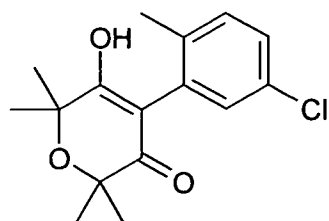


步驟 1：三乙酸 5-氯基-2-甲基苯鉛之製備



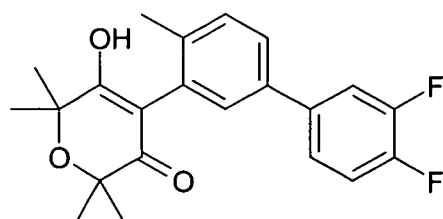
將無水氯仿（6 毫升）加入四乙酸鉛（2.15 公克，4.85 毫莫耳）與二乙酸汞（0.15 公克，0.47 毫莫耳）的以氮氣徹底沖洗之混合物中。將該混合物溫熱至 40℃，並加入一份 5-氯基-2-甲基苯基硼酸（0.76 公克，4.46 毫莫耳），並將懸浮液在該溫度下加熱 5 小時。在冷卻至室溫之後，將混合物濃縮成小體積，接著以己烷研製及過濾，得到粗三乙酸 5-氯基-2-甲基苯鉛（2.27 公克）。

步驟 2：4-(5-氯基-2-甲基苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



將無水氯仿（40 毫升）加入 2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（在 US5089046A 中所述）（0.504 公克，2.96 毫莫耳）與 N,N-二甲胺基吡啶（1.45 公克，11.84 毫莫耳）之混合物中。將粗三乙酸 5-氯基-2-甲基苯鉛（2.26 公克，4.44 毫莫耳）以一份加入該溶液中，並接著將混合物在 40°C 下加熱 17 小時（分析），接著在 45-50°C 下再加熱 23 小時。允許混合物冷卻至室溫，接著以乙酸乙酯（100 毫升）稀釋及以稀釋的水性氫氯酸（3 x 30 毫升）清洗。將有機相經無水硫酸鎂乾燥，接著濃縮，得到黃色膠，將其以管柱層析法（8：18：1 之比的乙酸乙酯 / 己烷 / 乙酸）純化，接著以己烷研製，以供應成為白色固體的 4-(5-氯基-2-甲基苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.53 公克）。

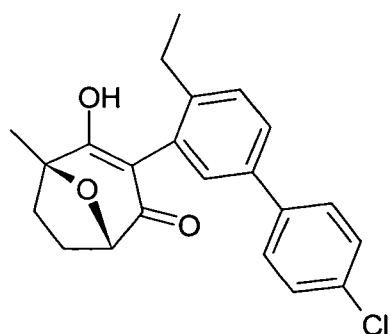
步驟 3：4-(3',4'-二氟基-4-甲基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



將 4-(5-氯基-2-甲基苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.20 公克，0.68 毫莫耳）、3,4-二氟苯基硼酸（0.107 公

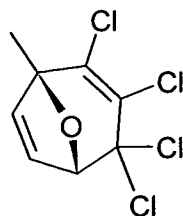
克，0.68 毫莫耳）、磷酸鉀（0.722 公克，3.40 毫莫耳）、乙酸鈹(II)（1.6 毫克，0.0068 毫莫耳）及 S-磷-3'-磺酸鈉（7.0 毫克，0.0136 毫莫耳）加入微波小瓶中。接著加入脫氣之蒸餾水（0.75 毫升）（從小瓶載片洗掉任何固體），接著攪拌 5 分鐘及以氫氣沖洗。接著將該混合物在微波照射下於 160°C 下加熱 15 分鐘，接著加入額外的 3,4-二氟苯基硼酸（0.107 公克，0.68 毫莫耳）及磷酸鉀（0.144 公克，0.68 毫莫耳），接著在微波照射下於 160°C 下再加熱 15 分鐘。在冷卻至室溫之後，將反應混合物以乙酸乙酯（3 毫升）稀釋及以稀釋的水性氫氯酸酸化至 pH 2。將有機相分開及將水相以乙酸乙酯（3 x 3 毫升）進一步萃取。接著將所有的有機物合併，經由二氧化矽塞過濾及蒸發，得到粗產物，將其溶解在 N,N-二甲基甲醯胺（2.5 毫升）中及以製備性反相 HPLC 純化，以供應成為白色固體的 4-(3',4'-二氟基-4-甲基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.190 公克）。

實施例 4：(1R*,5S*)-3-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-1-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛烷-2,4-二酮之製備



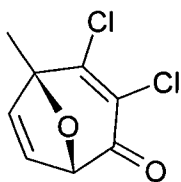
步驟 1：(1R*,5S*)-2,3,4,4-四氯基-1-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]

辛-2,6-二烯之製備



將五氯基環丙烷（100 公克，0.467 莫耳）加入在 1,4-二噁烷（3600 毫升）中的氫氧化鉀（31.4 公克，0.56 莫耳）之懸浮液中，並將混合物在室溫下攪拌 30 分鐘及接著加熱至 65℃ 再經 30 分鐘。將 2-甲基呋喃（38.36 公克，0.467 莫耳）加入反應混合物中，使溫度上升至 85-90℃ 及將混合物攪拌 16 小時。將反應混合物冷卻至室溫，經由矽藻土塞過濾及將過濾物在真空中蒸發，得到 (1R*,5S*)-2,3,4,4-四氯基-1-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛-2,6-二烯（83 公克），以未進一步純化而用於下一步驟中。

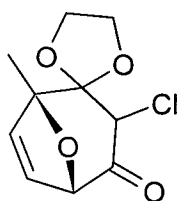
步驟 2：(1R*,5S*)-3,4-二氯基-5-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛-3,6-二烯-2-酮之製備



將硝酸銀（166 公克，0.982 莫耳）加入 (1R*,5S*)-2,3,4,4-四氯基-1-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛-2,6-二烯（83 公克，0.491 莫耳）、丙酮（1500 毫升）與水（1500 毫升）之攪

拌混合物中，並將混合物在 65°C 下加熱 16 小時。將反應混合物冷卻至室溫，並加入碳酸氫鈉飽和水溶液，使 pH 調整至 7-8。將混合物經由矽藻土塞過濾，並將過濾物在真空中濃縮，以移除大部分丙酮。將水性混合物以乙酸乙酯（3 x 500 毫升）萃取，並將有機萃取物合併，經無水硫酸鈉乾燥，過濾及將過濾物蒸發。將殘餘物在矽膠上以快速管柱層析法純化，得到成為黃色油的 (1R*,5S*)-3,4-二氯基-5-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛-3,6-二烯-2-酮（29.5 公克）。

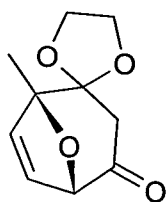
步驟 3：3-氯基-1-甲基-4-酮基-螺旋(1,3-二噁戊烷-2,2'-[8]氧雜雙環[3.2.1]辛-6-烯)之製備



將鈉（4.41 公克，0.204 莫耳）小心地加入乙二醇（99.75 公克）中及將混合物在氮大氣下於 35-40°C 下攪拌，直到鈉完全溶解為止。經 30 分鐘逐滴加入在四氫呋喃（200 毫升）中的 (1R*,5S*)-3,4-二氯基-5-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛-3,6-二烯-2-酮（28 公克，0.136 莫耳）之溶液，並在一經加完時，將混合物在室溫下攪拌 90 分鐘。反應混合物藉由加入 10% 水性磷酸二氫鈉而中和，並以乙酸乙酯（3 x 100 毫升）萃取。將有機萃取物合併，經無水硫酸鈉乾燥，

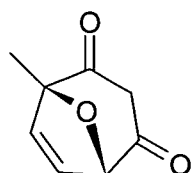
過濾及將過濾物蒸發。將殘餘物在矽膠上以快速管柱層析法純化，得到成為膠的 3-氯基-1-甲基-4-酮基-螺旋(1,3-二噁戊烷-2,2'-[8]氧雜雙環[3.2.1]辛-6-烯) (24.5 公克)。

步驟 4：(1R*,5S*)-1-甲基-4-酮基-螺旋(1,3-二噁戊烷-2,2'-[8]氧雜雙環[3.2.1]辛-6-烯)之製備



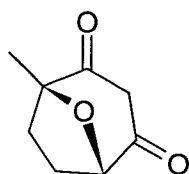
將鋅粉 (13.88 公克，0.212 莫耳) 加入在乙酸 (122.5 毫升) 中的 3-氯基-1-甲基-4-酮基-螺旋(1,3-二噁戊烷-2,2'-[8]氧雜雙環[3.2.1]辛-6-烯) (24.5 公克，0.016 莫耳) 之溶液中，並將反應混合物在室溫下攪拌 24 小時。將混合物以水 (612.5 毫升) 稀釋及以乙酸乙酯 (3 x 150 毫升) 萃取。將有機萃取物合併，經無水硫酸鈉乾燥，過濾及將過濾物蒸發，得到成為黃色油的 (1R*,5S*)-1-甲基-4-酮基-螺旋(1,3-二噁戊烷-2,2'-[8]氧雜雙環[3.2.1]辛-6-烯) (20 公克)，以未進一步純化而用於下一步驟中。

步驟 5：(1R*,5S*)-1-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛-6-烯-2,4-二酮之製備



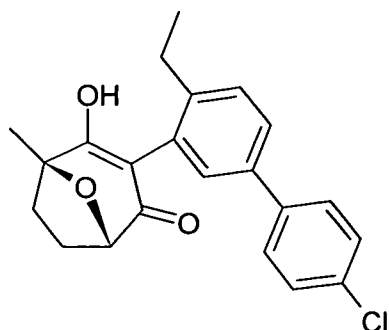
將氫氯酸（50 毫升）以三部分加入在丙酮（500 毫升）及水（250 毫升）中的(1R*,5S*)-1-甲基-4-酮基-螺旋(1,3-二噁戊烷-2,2'-[8]氧雜雙環[3.2.1]辛-6-烯)（20 公克，0.102 莫耳）之混合物中，並將反應混合物在 65-70°C 下攪拌 48 小時。將混合物冷卻至室溫，將大部分丙酮在減壓下以蒸發移除，並將所得水溶液以乙酸乙酯（3 x 100 毫升）萃取。將有機萃取物合併，經無水硫酸鈉乾燥，過濾及將過濾物蒸發。將殘餘物在矽膠上以快速管柱層析法純化，得到成為黃色油的(1R*,5S*)-1-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛-6-烯-2,4-二酮（10.0 公克）。

步驟 6：(1R*,5S*)-1-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛烷-2,4-二酮之製備



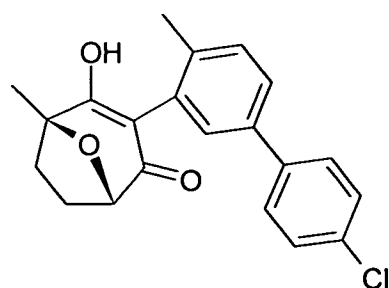
將 10% 鈦 / 碳（2.4 公克）加入在乙酸乙酯（100 毫升）中的(1R*,5S*)-1-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛-6-烯-2,4-二酮（12.0 公克，0.079 莫耳）之溶液中，接著在 1 巴氫氣大氣壓下攪拌 24 小時。接著將反應混合物經由矽藻土過濾及濃縮，得到粗產物，將其以快速管柱層析法（己烷 / 乙酸乙酯）純化，以供應成為淡黃色固體的(1R*,5S*)-1-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛烷-2,4-二酮（6.90 公克）。

步驟 7：(1R*,5S*)-3-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-1-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛烷-2,4-二酮之製備



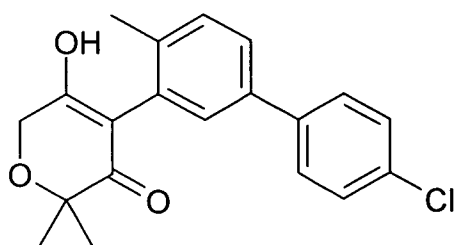
將(1R*,5S*)-1-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛烷-2,4-二酮(0.10 公克, 0.6 毫莫耳)及 N,N-二甲胺基-吡啶(0.395 公克, 3.2 毫莫耳)在氮大氣下以攪拌加入氯仿(2.0 毫升)與甲苯(0.5 毫升)之混合物中。將三乙酸 4'-氯基-4-乙基聯苯-3-鉛(0.42 公克, 0.70 毫莫耳)以一份加入該反應混合物中, 接著將混合物在 80°C 下加熱 1-2 小時。將反應混合物冷卻至室溫, 以稀釋的水性氫氯酸酸化, 接著經由矽藻土過濾, 以移除無機殘餘物(接著以二氯甲烷清洗)。將水性部分以二氯甲烷(2 x 5 毫升)萃取, 將所有的有機部分合併, 經硫酸鈉乾燥, 接著在真空下濃縮, 得到粗產物, 將其以快速層析法(己烷 / 乙酸乙酯)純化, 得到成為白色固體的(1R*,5S*)-3-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-1-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛烷-2,4-二酮(0.150 公克)。

實施例 5：(1R*,5S*)-3-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)-1-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛烷-2,4-二酮之製備

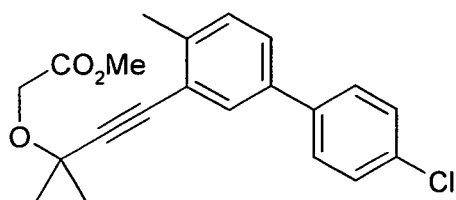


將 (1R*,5S*)-1-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛烷-2,4-二酮 (0.25 公克, 1.62 毫莫耳) 及 N,N-二甲胺基吡啶 (0.99 公克, 8.11 毫莫耳) 在氮大氣下以攪拌加入氯仿 (3.5 毫升) 與甲苯 (0.75 毫升) 之混合物中。接著將三乙酸 4'-氯基-4-甲基聯苯-3-鉛 (1.05 公克, 1.78 毫莫耳) 以一份加入該反應混合物中, 接著將混合物在 80°C 下加熱 1-2 小時。將反應混合物冷卻至室溫, 以稀釋的水性氫氯酸酸化, 接著經由矽藻土過濾, 以移除無機殘餘物 (接著以二氯甲烷清洗)。將水性部分以二氯甲烷 (2 x 10 毫升) 萃取, 接著將所有的有機部分合併, 經硫酸鈉乾燥及在真空下濃縮, 得到粗產物, 將其以快速層析法 (己烷 / 乙酸乙酯) 純化, 得到成為白色固體的 (1R*,5S*)-3-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)-1-甲基-8-氧雜雙環[3.2.1]辛烷-2,4-二酮 (0.240 公克)。

實施例 6: 4-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)-2,2-二甲基吡喃-3,5-二酮之製備



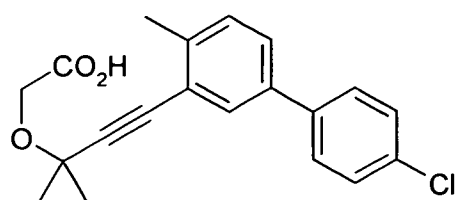
步驟 1：[3-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)-1,1-二甲基丙-2-炔氧基]乙酸甲酯之製備



將二氯化雙(三苯膦)鈀(II) (0.63 公克, 0.9 毫莫耳) 及碘化亞銅(I) (0.34 公克, 1.8 毫莫耳) 加入在三乙胺 (70 毫升) 中的 3-溴基-4'-氯基-4-甲基聯苯 (12.6 公克, 44.7 毫莫耳) 及 (1,1-二甲基丙-2-炔氧基) 乙酸甲酯 (根據 WO 2001/066544 所製備) (8.4 公克, 53.8 毫莫耳) 之溶液中。將反應混合物脫氣及以氮 (x 3) 沖洗, 接著在氮氣下於 80 °C 下攪拌 1 小時。將冷卻之混合物經由矽藻土過濾, 以移除催化劑, 並將過濾物在真空中蒸發。使殘餘物再接受相同的反應條件 (在氮氣下在 70 毫升三乙胺中的 8.4 公克 (1,1-二甲基丙-2-炔氧基) 乙酸甲酯、0.63 公克二氯化雙(三苯膦) 鈀(II)、0.34 公克碘化亞銅(I)) 及在 80 °C 下攪拌 1 小時。將冷卻之混合物經由矽藻土過濾, 接著在真空中濃縮及以快速層析法 (3:1 之己烷 / 乙酸乙酯) 純化, 以供應成為油的 [3-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)-1,1-二甲基丙-2-炔氧基] 乙酸甲酯 (6.70 公克)。

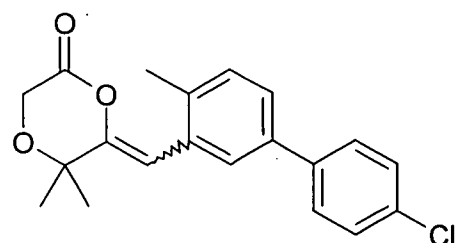
步驟 2：[3-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)-1,1-二甲基丙-2-炔

氧基]乙酸之製備



將氫氧化鉀（1.105 公克，19.7 毫莫耳）加入在二噁烷（20 毫升）及水（20 毫升）中的[3-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)-1,1-二甲基丙-2-炔氧基]乙酸甲酯（6.7 公克，18.8 毫莫耳）之溶液中。在 20℃ 下攪拌 4 小時之後，將反應混合物以二氯甲烷萃取兩次。將水層在 0℃ 下使用 1N 水性氫氯酸酸化至 pH 2-3 及以乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機萃取物經無水硫酸鈉乾燥，過濾及將過濾物在真空中蒸發。將殘餘物在己烷中攪拌及過濾，以供應成為白色固體（熔點 125℃）的[3-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)-1,1-二甲基丙-2-炔氧基]乙酸（4.50 公克）。

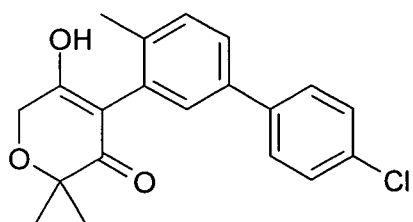
步驟 3：6-[1-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)亞甲基]-5,5-二甲基[1,4]二噁-2-酮之製備



將碳酸銀（0.17 公克，0.61 毫莫耳）加入在微波小瓶

中的無水乙腈（15 毫升）中的[3-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)-1,1-二甲基丙-2-炔氧基]乙酸（2.1 公克，6.13 毫莫耳）之溶液中。將反應混合物攪拌及在微波照射下加熱至 120 °C 經 40 分鐘，得到棕色懸浮液。將混合物在真空中蒸發，接著以水稀釋及以乙酸乙酯萃取。將合併的有機萃取物經無水硫酸鈉乾燥，過濾及將過濾物在真空中蒸發，得到成為固體的 6-[1-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)亞甲基]-5,5-二甲基[1,4]二噁-2-酮（1.75 公克）。

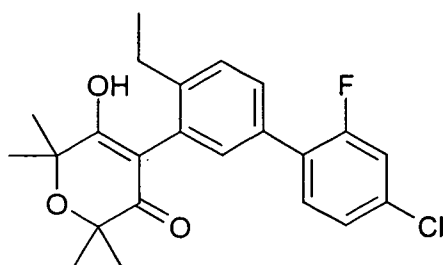
步驟 4：4-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)-2,2-二甲基吡喃-3,5-二酮之製備



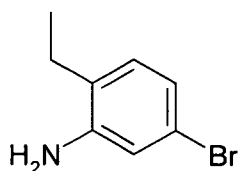
將三乙胺（0.67 毫升，4.81 毫莫耳）及氰化鉀（30 毫克，0.46 毫莫耳）加入在無水乙腈（22 毫升）中的 6-[1-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)亞甲基]-5,5-二甲基[1,4]二噁-2-酮（1.5 公克，4.36 毫莫耳）之懸浮液中。將反應混合物在回流下攪拌 2 小時。將冷卻之混合物以乙酸乙酯稀釋，並在 0°C 下加入 0.5N 水性氫氯酸。將有機層分開及將水相以乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機萃取物經無水硫酸鈉乾燥，過濾及將過濾物在真空中蒸發。將殘餘物以快速層析法（1：1 之比的庚烷 / 乙酸乙酯）純化，以供應成為泡沫

的 4-(4'-氯基-4-甲基聯苯-3-基)-2,2-二甲基吡喃-3,5-二酮 (1.35 公克)。將產物樣品在己烷 / 二異丙醚 (4:1 之比) 中攪拌及過濾，得到具有 186-188°C 之熔點的白色固體。

實施例 7：4-(4'-氯基-4-乙基-2'-氟基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



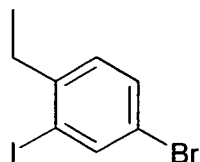
步驟 1：5-溴基-2-乙基苯胺之製備



將氯化錫(II)二水合物 (35.72 公克，225.71 毫莫耳) 加入在乙醇 (125 毫升) 中的 2-乙基-5-溴基硝苯 (9.71 公克，230 毫莫耳) 之溶液中，接著在 70°C 下加熱 2 小時。在冷卻至室溫之後，將溶液倒入碎冰 (1 公升) 中，接著以乙酸乙酯 (200 毫升) 稀釋。小心地加入固體碳酸鈉，直到達成 pH 7 為止，在該階段，將黏的混合物經由矽藻土過濾 (以乙酸乙酯 / 水性碳酸鈉進一步清洗) 及將相分開。在水相的額外萃取之後，將所有的有機相合併，經無水硫

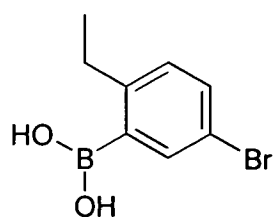
酸鎂乾燥，接著在真空中濃縮。將粗油在矽膠上以快速管柱層析法（8：2 之比的己烷 / 乙酸乙酯）純化，以供應成為棕色油的 5-溴基-2-乙基苯胺（7.89 公克）。

步驟 2：4-溴基-1-乙基-2-碘苯之製備



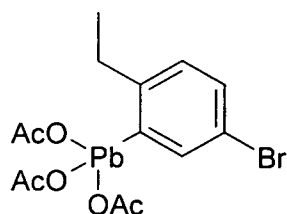
將濃縮硫酸（5.60 毫升）加入在蒸餾水（110 毫升）中的 5-溴基-2-乙基苯胺（3.39 公克，200 毫莫耳）之攪拌混合物中，接著在回流下短暫加熱，直到溶解為止。允許混合物冷卻至室溫，產生細沉澱物，接著在冰 / 鹽浴中進一步冷卻至約 0°C。將在蒸餾水（10 毫升）中的亞硝酸鈉（1.17 公克，16.94 毫莫耳）之水溶液經 15 分鐘逐滴加入該漿料中，使溫度維持在 5°C 以下，接著額外攪拌 30 分鐘。接著將反應混合物過濾，接著在室溫下逐滴加入在蒸餾水（45 毫升）中的碘化鉀（8.44 公克，50.83 毫莫耳）的第二種水溶液。在加完之後，將溶液短暫加熱至 80°C，接著允許再冷卻至室溫。將反應混合物以乙酸乙酯（3 x 50 毫升）萃取，並將有機相以 1M 水性氫氯酸（30 毫升）及水性硫代硫酸鈉（2 x 30 毫升）清洗。在經無水硫酸鎂乾燥及在真空中濃縮之後，供應成為橘色液體的 4-溴基-1-乙基-2-碘苯（4.90 公克）。

步驟 3：5-溴基-2-乙基苯基硼酸之製備



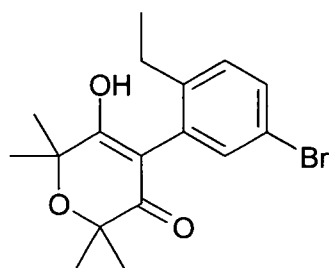
將氯化異丙基鎂（16.90 毫升，33.80 毫莫耳，在四氫呋喃中的 2M 溶液）逐滴加入在 -78°C 下在無水四氫呋喃（60 毫升）中的 4-溴基-1-乙基-2-碘苯（10.00 公克，32.20 毫莫耳）之溶液中，使溫度維持在 60°C 以下。在攪拌 20 分鐘之後，允許反應混合物緩慢溫熱至室溫，接著再攪拌 1 小時。將溶液再冷卻至 -78°C 及逐滴加入硼酸三甲酯（7.18 毫升，64.32 毫莫耳），然後再允許混合物以再攪拌 2 小時而溫熱至室溫。加入稀釋的水性氫氯酸（30 毫升）及將粗產物萃取至乙酸乙酯（100 毫升）中。將水相以乙酸乙酯（2 x 100 毫升）清洗，並將所有的有機物合併，經無水硫酸鎂乾燥，接著在真空中濃縮，得到淺棕色固體，將其以己烷研製，以供應成為乳白粉末的 5-溴基-2-乙苯基硼酸（6.46 公克）。

步驟 4：三乙酸 5-溴基-2-乙基苯鉛之製備



將無水氯仿 (42 毫升) 加入四乙酸鉛 (13.7 公克, 31.00 毫莫耳) 與二乙酸汞 (0.47 公克, 1.50 毫莫耳) 的以氮氣徹底沖洗之混合物中。將該混合物溫熱至 40°C, 並加入一份 5-溴基-2-乙苯基硼酸 (6.50 公克, 28.00 毫莫耳), 並將懸浮液在該溫度下加熱 5 小時。接著允許混合物冷卻至室溫, 接著進一步冷卻至 0°C, 接著以快速攪拌經 5 分鐘加入粉末狀無水碳酸鉀 (3.22 公克), 接著過濾。將過濾物濃縮成其一半體積, 接著加入己烷, 以誘發沉澱。將該混合物進一步濃縮, 將溶劑傾析及將固體以己烷清洗, 以供應成為沙色固體的三乙酸 5-溴基-2-乙基苯鉛 (10.69 公克)。

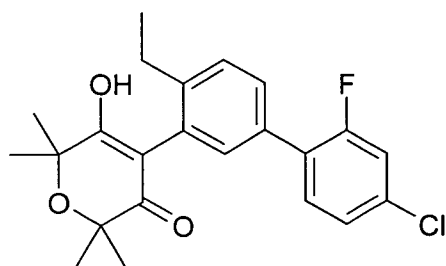
步驟 5: 4-(5-溴基-2-乙苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



將無水氯仿 (120 毫升) 加入 2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (3.57 公克, 21.00 毫莫耳) 與 N,N-二甲胺基吡啶 (13.50 公克, 111.00 毫莫耳) 之混合物中, 接著在室溫下攪拌, 直到溶解為止。將無水甲苯 (37 毫升) 加入該溶液中, 接著加入一份三乙酸 5-溴基-2-乙基苯鉛 (10.69 公克, 24.00 毫莫耳), 並將反應混合物在 80°C 下加熱 2 小時, 接著允

許在室溫下放置隔夜。將混合物以二氯甲烷（185 毫升）及以稀釋的水性氫氯酸（185 毫升）稀釋，接著渦動 5 分鐘及過濾，以移除無機殘餘物（以二氯甲烷額外清洗）。將所有的有機部分合併，以鹽水清洗，經無水硫酸鎂乾燥，接著在真空中濃縮，以供應粗油，將其以快速管柱層析法（5：1 之比的己烷 / 乙酸乙酯）進一步純化，得到成為黃色固體的產物（4.47 公克）。鉛殘餘物係藉由將該固體溶解在氯仿（50 毫升）中及與 3-巰丙基官能化之矽膠（5.50 公克，1.20 毫莫耳 / 公克之裝載）攪拌隔夜而移除。在過濾及濃縮之後，供應成為乳白粉末的 4-(5-溴基-2-乙苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（4.36 公克）。

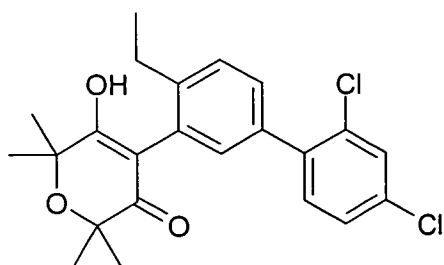
步驟 6：4-(4'-氯基-4-乙基-2'-氟基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



將脫氣之二甲氧基乙烷（2 毫升）加入 4-(5-溴基-2-乙苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.278 公克，0.79 毫莫耳）、氟化鈾（1.19 公克，7.90 毫莫耳）、4-氯基-2-氟苯基硼酸（0.194 公克，1.11 毫莫耳）與[1,1'-雙(二苯膦基)二茂鐵]二氯基-鈹(II)（0.102 公克，0.12 毫莫耳）之混合物中，並將所得懸浮液在氮氣下攪拌 45 分鐘，接著在 80

℃下加熱 20 小時。在冷卻至室溫之後，將反應混合物分溶在乙酸乙酯與 1M 水性氫氯酸之間。將水相以乙酸乙酯進一步萃取，接著將所有的有機部分合併，經無水硫酸鎂乾燥及在真空中濃縮。將所得物質在矽膠上以管柱層析法（3：1 之比的己烷 / 乙酸乙酯）純化，以供應成為白色固體的 4-(4'-氯基-4-乙基-2'-氟基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.248 公克）。

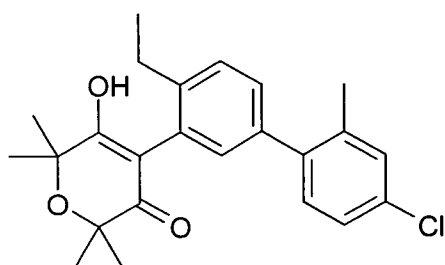
實施例 8：4-(2',4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



將脫氣之二噶烷（2.5 毫升）加入 4-(5-溴基-2-乙苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.278 公克，0.79 毫莫耳）、氟化鈾（1.19 公克，7.90 毫莫耳）與 2,4-二氯苯基硼酸（0.30 公克，1.58 毫莫耳）之混合物中，並將所得懸浮液在氮氣下攪拌 45 分鐘，經過該時間形成牛奶狀懸浮液。接著將[1,1'-雙(二苯膦基)二茂鐵]-二氯基鈹(II)（0.102 公克，0.12 毫莫耳）以一份加入該懸浮液中，並將混合物在約 100℃下加熱 3 小時。在冷卻至室溫之後，加入二氯甲烷（150 毫升），並將溶液以 1M 氫氯酸（150 毫升）清洗。將有機相分開，經無水硫酸鎂乾燥，過濾及將過濾物

在真空中濃縮，以供應粗油，將其以管柱層析法（5：1 之比的己烷 / 乙酸乙酯）純化，得到成為泡沫之產物。以己烷研製，以供應成為白色固體的 4-(2',4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.250 公克）。

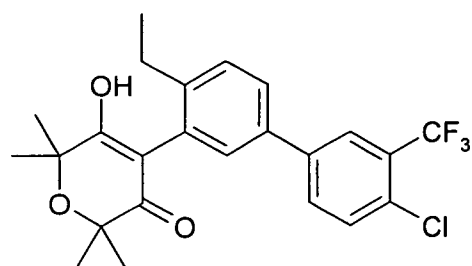
實施例 9：4-(4'-氯基-4-乙基-2'-甲基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



將乙酸鈣(II)（3.3 毫克，0.015 毫莫耳）、參(3-磺苯基)膦三鈉鹽（22 毫克，0.038 毫莫耳）、4-氯基-2-甲基苯基硼酸（0.152 公克，0.89 毫莫耳）、4-(5-溴基-2-乙苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.208 公克，0.59 毫莫耳）及磷酸鉀（0.625 公克，2.95 毫莫耳）加入微波小瓶中。接著加入乙腈 / 蒸餾水之脫氣混合溶液（1.5 毫升，1：1 之比）（從小瓶載片洗掉任何固體），接著攪拌 5 分鐘及以氫氣沖洗。接著將該混合物在微波照射下於 160°C 下加熱 15 分鐘。在冷卻至室溫之後，將反應混合物以乙酸乙酯（3 毫升）稀釋及以稀釋的水性氫氯酸酸化至 pH 2。將有機相分開及將水相以乙酸乙酯（2 x 3 毫升）進一步萃取。接著將所有的有機物合併，經由二氧化矽塞過濾及蒸發，得到粗產物，將其溶解在 N,N-二甲基甲醯胺（2.5 毫升）

中及以製備性反相 HPLC 純化，以供應成為白色粉末的 4-(4'-氯基-4-乙基-2'-甲基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (0.139 公克)。

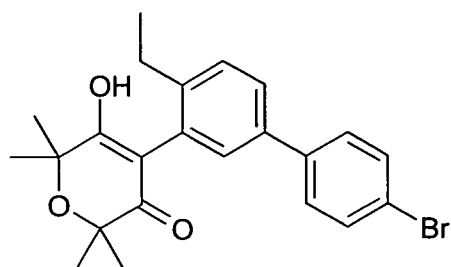
實施例 10：4-(4'-氯基-4-乙基-3'-三氟甲基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



將乙酸鈣(II) (3.3 毫克, 0.015 毫莫耳)、參(3-磺苯基)膦三鈉鹽 (22 毫克, 0.038 毫莫耳)、4-氯基-3-三氟甲基苯基硼酸 (0.200 公克, 0.89 毫莫耳)、4-(5-溴基-2-乙苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (0.208 公克, 0.59 毫莫耳) 及磷酸鉀 (0.625 公克, 2.95 毫莫耳) 加入微波小瓶中。接著加入乙腈 / 蒸餾水之脫氣混合溶液 (1.5 毫升, 1:1 之比) (從小瓶載片洗掉任何固體), 接著攪拌 5 分鐘及以氫氣沖洗。接著將該混合物在微波照射下於 160°C 下加熱 15 分鐘。在冷卻至室溫之後, 將反應混合物以乙酸乙酯 (3 毫升) 稀釋及以稀釋的水性氫氯酸酸化至 pH 2。將有機相分開及將水相以乙酸乙酯 (2 x 3 毫升) 進一步萃取。接著將所有的有機物合併, 經由二氧化矽塞過濾及蒸發, 得到粗產物, 將其溶解在 N,N-二甲基甲醯胺 (2.5 毫升) 中及以製備性反相 HPLC 純化, 以供應成為白色粉末的 4-(4'-氯基-4-乙基-3'-三氟甲基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲

基吡喃-3,5-二酮 (0.143 公克)。

實施例 11：4-(4'-溴基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



步驟 1a

將 4-(4'-胺基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (0.260 公克, 0.71 毫莫耳) 分批加入氫溴酸 (在水中的 48 重量%之溶液, 1.7 毫升) 與水 (1.2 毫升) 之混合物中, 並在一經加完時, 將混合物加熱至 40°C 及攪拌 20 分鐘, 然後在冰浴中冷卻至 5°C。經 20 分鐘逐滴加入在水 (1.2 毫升) 中的亞硝酸鈉 (0.099 公克, 1.40 毫莫耳) 之溶液, 並在一經加完時, 將混合物在 5°C 下再攪拌 45 分鐘。

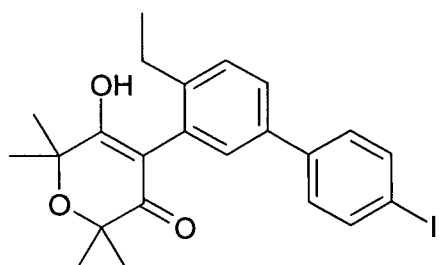
步驟 1b

同時, 將硫酸銅五水合物 (0.388 公克, 1.55 毫莫耳) 以一份加入在 70°C 下的氫溴酸溶液 (在水中的 48 重量%之溶液, 3.3 毫升) 中, 並將混合物在 70°C 下攪拌 2 分鐘, 得到深紫色溶液, 並接著加入銅粉 (0.135 公克, 2.15 毫莫耳) 及 (0.030 公克, 0.47 毫莫耳), 生成粉紅色懸浮液。

步驟 1c

將含有重氮鹽之混合物（在步驟 1a 中所製備）分批加入在 5℃ 下在步驟 1b 中所製備之攪拌混合物中，接著在 70℃ 下再加熱 45 分鐘。在冷卻至室溫之後，將反應混合物以乙酸乙酯萃取，以水及鹽水清洗，接著經無水硫酸鎂乾燥及在真空中濃縮。以快速管柱層析法（3：1 之比的己烷 / 乙酸乙酯）純化，得到粗固體，將其以己烷 / 二乙醚研製，以供應成為白色固體的 4-(4'-溴基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.045 公克）。

實施例 12：4-(4'-碘基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備

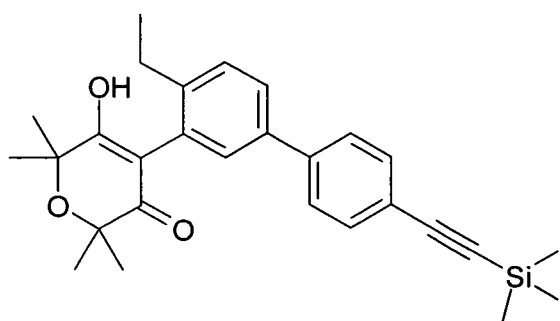


將 4-(4'-胺基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.65 公克，1.80 毫莫耳）加入在乙腈（11 毫升）中的對-甲苯磺酸單水合物（1.03 公克，5.40 毫莫耳）之溶液中，接著在室溫下攪拌 10 分鐘，接著冷卻至 10℃。接著將在蒸餾水（1.3 毫升）中的亞硝酸鈉（0.25 公克，3.60 毫莫耳）及碘化鉀（0.76 公克，4.50 毫莫耳）的第二種混合溶液加入該混合物中，並接著將混合物在 10℃ 下攪拌 20 分鐘，接著在室溫下攪拌 2 小時。加入碳酸氫鈉水溶液，

直到達成 pH 9-10 為止，接著以乙酸乙酯稀釋及以飽和水性偏亞硫酸氫鈉（20 毫升）清洗。在使用乙酸乙酯（x 2）額外萃取水相之後，將所有的有機部分合併，以蒸餾水及鹽水清洗，接著經無水硫酸鎂乾燥及在真空中濃縮。將該粗產物在矽膠上以快速管柱層析法（3：1 之比的己烷 / 乙酸乙酯）純化，得到橘色膠，將其以己烷研製，以供應成為白色固體的 4-(4'-碘基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.413 公克）。

實施例 13：4-(4-乙基-4'-乙炔基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備

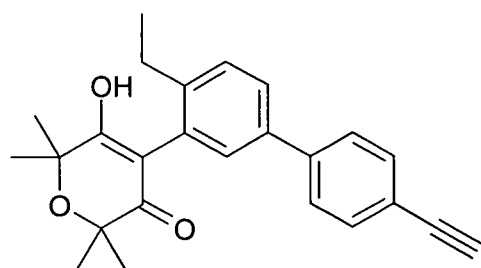
步驟 1：4-[4-乙基-4'-(三甲基矽烷基乙炔基)聯苯-3-基]-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



將在無水 N,N-二甲基甲醯胺（0.25 毫升）中的 4-(4'-碘基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.200 公克，0.42 毫莫耳）、三甲基矽烷基乙炔（0.10 毫升，0.47 毫莫耳）、碘化亞銅（4 毫克，0.023 毫莫耳）、氯化雙(三苯膦)鈦(II)（0.016 公克，0.023 毫莫耳）、三苯膦（0.022 公克，0.084 毫莫耳）與二乙胺（0.65 毫升）之混合物在

微波照射下於 120°C 下加熱 25 分鐘。接著允許該混合物冷卻至室溫及經由矽藻土過濾（以二氯甲烷額外清洗）。將溶劑在減壓下移除及將殘餘物在矽膠上以快速管柱層析法（9：1 至 3：1 之比的己烷 / 乙酸乙酯）純化，得到成為白色固體的 4-[4-乙基-4'-(三甲基矽烷基乙炔基)聯苯-3-基]-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.143 公克），以未進一步純化而用於下一步驟中。

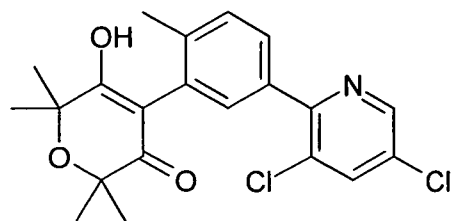
步驟 2：4-(4-乙基-4'-乙炔基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



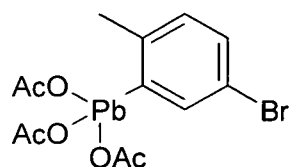
將粉末狀碳酸鉀（0.177 公克，1.28 毫莫耳）加入在甲醇（6.5 毫升）中的 4-[4-乙基-4'-(三甲基矽烷基乙炔基)聯苯-3-基]-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.143 公克，0.32 毫莫耳）之溶液中，並將混合物在室溫下攪拌 1 小時。接著加入水，以溶解全部的無機物，並將混合物在真空中濃縮。加入 2M 氫氯酸，以達成 pH 2-3，接著將所欲物質以乙酸乙酯（x 3）萃取。將所有的有機物合併，以鹽水清洗，經無水硫酸鎂乾燥，接著在真空中濃縮。將殘餘物在矽膠上以快速管柱層析法（4：1 之比的己烷 / 乙酸乙酯）進一步純化，以供應成為黃色固體的 4-(4-乙基-4'-乙炔基聯苯-

3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (0.070 公克)。

實施例 14：4-[5-(3,5-二氯基吡啶-2-基)-2-甲基苯基]-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備

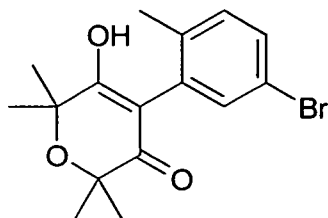


步驟 1：三乙酸 5-溴基-2-甲基苯鉛之製備



將無水氯仿 (35 毫升) 加入四乙酸鉛 (11.25 公克, 25.40 毫莫耳) 與二乙酸汞 (0.40 公克, 1.27 毫莫耳) 的以氮氣徹底沖洗之混合物中。將該混合物溫熱至 40°C, 並加入一份 5-溴基-2-甲基苯基硼酸 (4.96 公克, 23.10 毫莫耳), 並將懸浮液在該溫度下加熱 5 小時。接著允許混合物冷卻至室溫, 接著進一步冷卻至 0°C, 接著以快速攪拌經 5 分鐘加入粉末狀無水碳酸鉀 (1.61 公克)。將混合物過濾, 將過濾物濃縮成其一半體積, 並加入己烷, 以誘發沉澱。將該混合物進一步濃縮, 將溶劑傾析及將固體以己烷清洗, 以供應成為沙色固體的三乙酸 5-溴基-2-甲基苯鉛 (10.10 公克)。

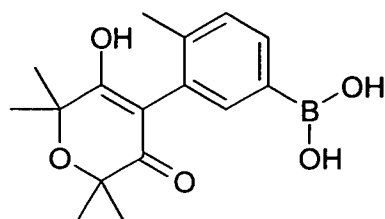
步驟 2：4-(5-溴基-2-甲基苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



將無水氯仿（200 毫升）加入 2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（6.00 公克，35.29 毫莫耳）與 N,N-二甲胺基吡啶（21.62 公克，177.21 毫莫耳）之混合物中，接著在室溫下攪拌，直到溶解為止。將無水甲苯（55 毫升）加入該溶液中，接著加入一份三乙酸 5-溴基-2-甲基苯鉛（21.60 公克，38.99 毫莫耳）及將反應混合物在 80℃ 下加熱 2 小時。允許混合物冷卻至室溫，接著以二氯甲烷（300 毫升）及水性氫氯酸（300 毫升）稀釋，並將混合物渦動 5 分鐘及過濾，以移除無機殘餘物。將濾餅以二氯甲烷清洗，並將所有的有機部分合併，經無水硫酸鎂乾燥，過濾及將過濾物在真空中濃縮，以供應粗固體，將其從二氯甲烷 / 己烷再結晶。接著將該物質以快速管柱層析法（5：1 之比的己烷 / 乙酸乙酯）進一步純化。鉛殘餘物係藉由將該所得固體（約 6.50 公克）溶解在氯仿（100 毫升）中及與 3-巰丙基官能化之矽膠（6.50 公克，1.20 毫莫耳 / 公克之裝載）攪拌隔夜而移除。將混合物過濾及將過濾物在真空中濃縮，以供應成為乳白粉末的 4-(5-溴基-2-甲基苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-

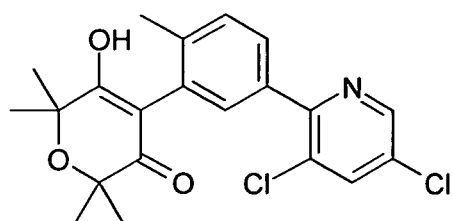
3,5-二酮 (6.50 公克)。

步驟 3：4-甲基-3-(2,2,6,6-四甲基-3,5-二酮基四氫吡喃-4-基)苯基硼酸之製備



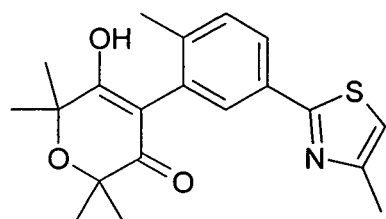
將 4-(5-溴基-2-甲苄基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (5 公克, 0.0147 莫耳) 溶解在無水四氫呋喃 (150 毫升) 中, 將反應混合物冷卻至 0°C 及加入氫化鈉 (708 毫克, 0.0294 莫耳, 在油中的 60% 分散液)。將混合物攪拌 30 分鐘, 接著冷卻至 -78°C。經約 10 分鐘逐滴加入正-丁基鋰 (14.7 毫升, 0.0294 莫耳, 在環己烷中的 2M 溶液), 並將反應混合物攪拌 15 分鐘, 然後加入硼酸三甲酯 (4.95 毫升, 0.0442 莫耳)。將反應混合物再攪拌 45 分鐘, 允許溫熱至周圍溫度及接著再攪拌 1.5 小時, 然後以 2M 水性氫氯酸中止。將反應混合物攪拌 1 小時及接著以二氯甲烷萃取。在分開有機相之後, 將溶劑在減壓下移除, 得到淡黃色膠。以異己烷研製, 以供應成為白色固體的 4-甲基-3-(2,2,6,6-四甲基-3,5-二酮基四氫吡喃-4-基)苯基硼酸 (2.01 公克)。

步驟 4：4-[5-(3,5-二氯基吡啶-2-基)-2-甲苄基]-2,2,6,6-四甲基-3,5-二酮之製備



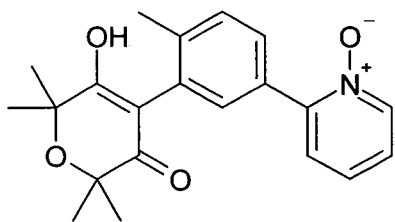
將 4-甲基-3-(2,2,6,6-四甲基-3,5-二酮基四氫吡喃-4-基) 苯基硼酸 (200 毫克, 0.657 毫莫耳)、2-溴基-3,5-二氯吡啶 (149 毫克, 0.657 毫莫耳)、乙酸鈮 (3.7 毫克, 0.0164 毫莫耳)、參(3-磺苯基)膦三鈉鹽 (22 毫克, 0.0394 毫莫耳) 及磷酸鉀 (697 毫克, 3.28 莫耳) 加入微波小瓶中, 接著加入水 / 乙腈的脫氣之溶劑混合物 (1.6 毫升, 2:1 之比)。將混合物以氬氣沖洗, 接著在周圍溫度下攪拌 5 分鐘, 然後在微波照射下於 160°C 下加熱 15 分鐘。在冷卻至室溫之後, 將反應分溶在 2M 水性氫氯酸與二氯甲烷之間, 並將有機相分開。將水相以二氯甲烷進一步萃取, 並將所有的有機部分合併, 接著蒸發。將殘餘物以製備性反相 HPLC 純化, 得到 4-[5-(3,5-二氯基吡啶-2-基)-2-甲基基]-2,2,6,6-四甲基-3,5-二酮 (113 毫克)。

實施例 15: 4-[2-甲基-5-(4-甲基噻唑-2-基)苯基]-2,2,6,6-四甲基-3,5-二酮之製備



將水 / 乙腈的脫氣之溶劑混合物 (1.5 毫升, 1:1 之比) 加入 4-(5-溴基-2-甲基苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (200 毫克, 0.589 毫莫耳)、4-甲基噻唑 (70 毫克, 0.707 毫莫耳)、碳酸銀 (814 毫克, 2.94 毫莫耳)、三苯膦 (15 毫克, 0.0589 毫莫耳) 與氯化[1,1'-雙(二苯膦基)二茂鐵]鈹(II) (24 毫克, 0.0294 毫莫耳) 之混合物中, 接著以氮氣沖洗, 接著在 65°C 下以搖動加熱 65 小時。在冷卻至室溫之後, 接著將反應混合物分溶在 2M 水性氫氯酸與二氯甲烷之間, 並將有機相分開。將水層以另一份二氯甲烷清洗, 並將合併的有機層在減壓下蒸發, 得到棕色固體, 將其以製備性反相 HPLC 純化, 得到成為淡黃色固體的 4-[2-甲基-5-(4-甲基噻唑-2-基)苯基]-2,2,6,6-四甲基-3,5-二酮 (36 毫克)。

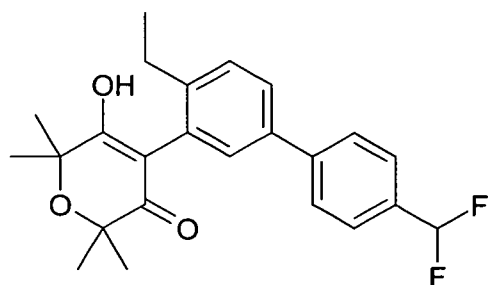
實施例 16: 4-[2-甲基-5-(1-氧吡啶-2-基)苯基]-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



將在甲苯 (1 毫升) 中的 4-(5-溴基-2-甲基苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (30 毫克, 0.0888 毫莫耳)、吡啶-N-氧化物 (33.7 毫克, 0.355 毫莫耳)、乙酸鈹 (1 毫克, 0.0044

毫莫耳)、碳酸鉀(24.5 毫克, 0.1775 毫莫耳)與四氟硼酸三-第三丁基鎂(3.86 毫克, 0.0133 毫莫耳)之混合物在 110°C 下以搖動加熱 18 小時。在冷卻至室溫之後, 將反應混合物在減壓下蒸發及將殘餘物以製備性反相 HPLC 純化, 得到成為無色膠的 4-[2-甲基-5-(1-氧吡啶-2-基)苯基]-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮(5.2 毫克)。

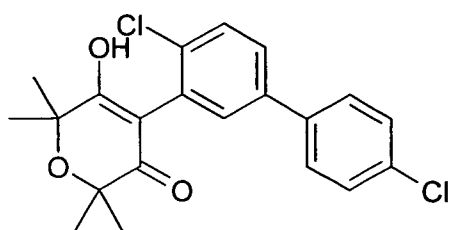
實施例 17: 4-(4'-二氟甲基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



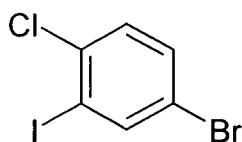
將三氟化(二乙胺基)硫(0.14 毫升, 1.06 毫莫耳)在 0°C 下逐滴加入在無水二氯甲烷(4 毫升)中的 4-(4'-甲酰-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮(0.110 公克, 0.3 毫莫耳)之溶液中。在攪拌 1 小時之後, 允許混合物溫熱至室溫, 並將溶液再攪拌隔夜。接著將溶液在冰浴中冷卻, 並經 30 分鐘以劇烈攪拌加入飽和水性碳酸鈉(4 毫升)。將反應混合物以乙酸乙酯(x 2)稀釋, 接著將兩層分開, 並將水相以乙酸乙酯進一步萃取。將有機萃取物合併, 以鹽水清洗及經無水硫酸鎂乾燥。將混合物過濾, 將過濾物在真空中蒸發及將殘餘物以製備性反相層析

法純化，以供應成為白色固體的 4-(4'-二氯甲基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (0.015 公克)。

實施例 18：4-(4,4'-二氯基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備

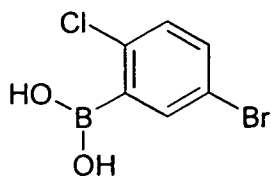


步驟 1：4-溴基-1-氯基-2-碘苯之製備



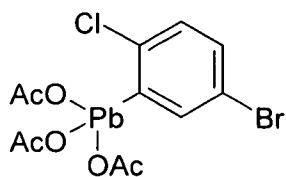
將亞硝酸第三丁酯 (3 毫升, 25 毫莫耳) 加入在乙腈 (60 毫升) 中的氯化銅(II) (2.71 公克, 20 毫莫耳) 之懸浮液中及將混合物以攪拌加熱至 60°C。逐滴加入在乙腈 (15 毫升) 中的 4-溴基-2-碘基苯胺 (5 公克, 17 毫莫耳) 之溶液，並在一經加完時，將混合物在 60°C 下攪拌 2.5 小時。將混合物冷卻至室溫，倒入 20% 水性氫氯酸中及以二乙醚萃取。將有機萃取物經無水硫酸鎂乾燥，過濾及將過濾物在真空中蒸發。將殘餘物在矽膠上以管柱層析法進一步純化，得到成為油的 4-溴基-1-氯基-2-碘苯 (4.32 公克)。

步驟 2：5-溴基-2-氯苯基硼酸之製備



將 4-溴基-1-氯基-2-碘苯 (10.35 公克, 33 毫莫耳) 溶解在無水四氫呋喃 (60 毫升) 中, 並將溶液在氬大氣下冷卻至 -75°C 。經 30 分鐘逐滴加入氯化異丙基鎂 (17.1 毫升, 34 毫莫耳, 在四氫呋喃中的 2M 溶液), 使溫度以外部冷卻而維持內部溫度在 -70°C 以下。在一經加完時, 將反應混合物在約 -70°C 下在攪拌 30 分鐘, 並接著允許溫熱至室溫及攪拌 1 小時。接著將反應混合物溶液冷卻至 -78°C 及逐滴加入硼酸三甲酯 (7.3 毫升, 65 毫莫耳)。將混合物在 -78°C 下攪拌 30 分鐘及接著移除冷卻浴, 並將混合物在室溫下攪拌 1.5 小時。加入 2M 水性氫氯酸 (30 毫升) 及接著將粗產物以乙酸乙酯萃取。將有機相以水及鹽水清洗, 經無水硫酸鎂乾燥, 過濾及將過濾物在真空中蒸發。以己烷研製, 得到成為灰白色固體的 5-溴基-2-氯苯基硼酸 (6.16 公克)。

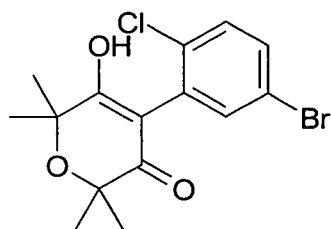
步驟 3: 三乙酸 5-溴基-2-氯基苯鉛之製備



將無水氯仿 (2.5 毫升) 加入四乙酸鉛 (1.46 公克, 3.3

毫莫耳) 與二乙酸汞 (42 毫克, 0.13 毫莫耳) 的以氫氣徹底沖洗之混合物中, 並將反應混合物攪拌及加熱至 40°C。加入一份 5-溴基-2-氯苯基硼酸 (0.62 公克, 2.6 毫莫耳), 並將反應混合物在 40°C 下攪拌 4 小時。在冷卻至室溫之後, 加入碳酸鉀 (0.18 公克), 將混合物劇烈攪拌 5 分鐘及接著過濾。將過濾物在真空中濃縮, 得到三乙酸 5-溴基-2-氯基苯鉛 (1.23 公克), 以未進一步純化而用於下一步驟中。

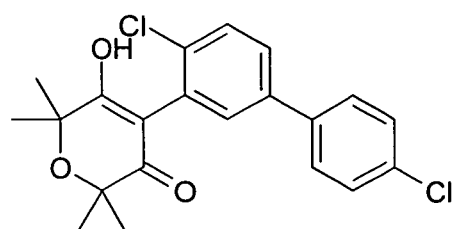
步驟 4: 4-(5-溴基-2-氯苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



將無水氯仿 (120 毫升) 加入 2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (2.78 公克, 16.3 毫莫耳) 與 N,N-二甲胺基吡啶 (9.97 公克, 81.6 毫莫耳) 之混合物中。將無水甲苯 (30 毫升) 加入該溶液中, 接著加入一份三乙酸 5-溴基-2-氯基苯鉛 (10.32 公克, 18 毫莫耳), 並將反應混合物在 80°C 下加熱隔夜。允許混合物冷卻至室溫, 接著以二氯甲烷 (120 毫升) 及 2M 水性氫氯酸 (250 毫升) 稀釋, 接著經由矽藻土過濾, 以移除無機殘餘物。將濾餅以二氯甲烷清洗, 並將所有的有機部分合併, 以 2M 氫氯酸、水及鹽水清洗, 經無水硫酸鎂乾燥, 接著在真空中濃縮。將該物質最終在

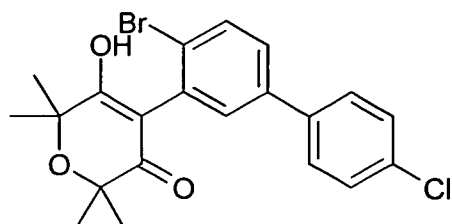
矽膠上以快速管柱層析法純化，以供應 4-(5-溴基-2-氯苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.44 公克），其具有足夠的純度於下一步驟中直接使用。

步驟 5：4-(4,4'-二氯基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備

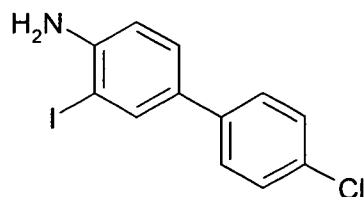


將 4-(5-溴基-2-氯苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.22 公克，0.6 毫莫耳）、4-氯苯基硼酸（0.14 公克，0.9 毫莫耳）與氟化鉀（0.28 公克，1.8 毫莫耳）之混合物一起經 45 分鐘加入在氮大氣及室溫下的 1,2-二甲氧基乙烷（2.4 毫升）中。加入 [1,1'-雙(二苯膦基)二茂鐵]二氯基鈣(II)（80 毫克，0.098 毫莫耳）及將反應混合物在 80°C 下加熱隔夜。將反應混合物經由矽藻土過濾，將濾餅以二氯甲烷（7 毫升）及水（3 毫升）清洗。混合物係藉由加入 2M 水性氫氯酸而酸化至 pH 1，並將有機相分開。將水相以二氯甲烷萃取及將所有的有機萃取物合併，經無水硫酸鎂乾燥，過濾及將過濾物蒸發。將殘餘物溶解在 N,N-二甲基甲醯胺（約 1 毫升）中及以製備性反相 HPLC 純化，得到 4-(4,4'-二氯基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（80 毫克）。

實施例 19：4-(4-溴基-4'-氯基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備

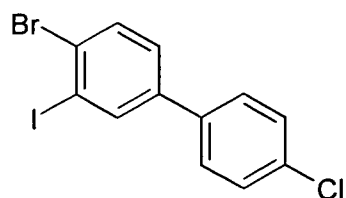
喃-3,5-二酮之製備

步驟 1：4'-氯基-3-碘基聯苯-4-胺之製備



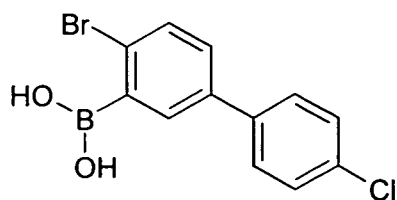
將氯酸鉀（0.830 公克，6.77 毫莫耳）及碘化鉀（3.32 公克，0.02 莫耳）加入在甲醇（10 毫升）與蒸餾水（40 毫升）之混合的溶劑系統中的 4'-氯基聯苯-4-胺（2.03 公克，0.01 毫莫耳）之溶液中。在將反應混合物加熱至 80°C 之後，加入濃縮氫氯酸（0.60 毫升），並將混合物在該溫度下進一步加熱隔夜。將溶液冷卻至室溫及將粗產物以二乙醚（x 3）萃取，接著將合併的有機部分以 5% 硫代硫酸鈉水溶液及蒸餾水清洗。將有機相經無水硫酸鎂乾燥，過濾及將過濾物在真空中蒸發，得到深色固體，將其以己烷研製，以供應成為淺棕色固體的 4'-氯基-3-碘基聯苯-4-胺（2.94 公克）。

步驟 2：4-溴基-4'-氯基-3-碘基聯苯之製備



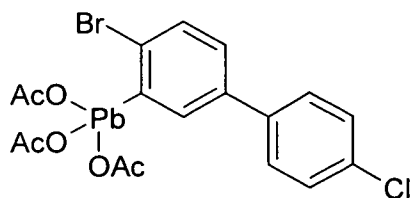
將 4'-氯基-3-碘基聯苯-4-胺（13.5 公克，0.041 莫耳）研磨成細粉末及懸浮在 48% 水性溴化氫（54 毫升）與蒸餾水（42 毫升）之混合物中。接著將懸浮液加熱至 45°C 經 30 分鐘，接著冷卻 0-5°C，並逐滴加入在蒸餾水（6 毫升）中的亞硝酸鈉（3.54 公克，0.0125 莫耳）之溶液，使內部溫度始終維持在 5°C 以下。接著將該混合物分批加入在 80°C 下在 48% 水性溴化氫（80 毫升）中的硫酸銅(II)五水合物（15 公克，0.06 莫耳）與銅粉（5.29 公克，0.084 莫耳）的第二種預形成之懸浮液中。當加完時，將反應混合物在 80°C 下再攪拌 90 分鐘。在冷卻至室溫之後，加入乙酸乙酯，並將反應混合物倒入蒸餾水中及將兩層分開。將水相以乙酸乙酯（x 2）進一步萃取，並將合併的有機萃取物以蒸餾水清洗，直到達成中性 pH 為止，接著經無水硫酸鎂乾燥。將混合物過濾，將過濾物在真空中蒸發及將殘餘物在矽膠上以快速管柱層析法（己烷溶離劑）進一步純化，以供應成為淡橘色液體的 4-溴基-4'-氯基-3-碘基聯苯（10.5 公克）。

步驟 3：4-溴基-4'-氯基聯苯-3-基硼酸之製備



將溴化異丙基鎂（31.60 毫升，在四氫呋喃中的 15% 溶液）逐滴加入在 -75°C 下在無水二乙醚（80 毫升）與無水四氫呋喃（80 毫升）之混合的溶劑系統中的 4-溴基-4'-氯基-3-碘基聯苯（8.00 公克，20.40 毫莫耳）之溶液中，使反應混合物的溫度維持在 -70°C 以下。當加完時，將混合物在 -75°C 下再攪拌 2 小時，接著允許溫熱至 -25°C ，在此時，逐滴加入硼酸三甲酯（3.15 公克，30.60 毫莫耳）。在加完之後，允許反應溫熱至室溫及攪拌隔夜，接著在冰浴中冷卻及以 2M 水性氫氯酸酸化。將粗產物以乙酸乙酯（x 3）萃取，並將有機部分合併，以鹽水清洗，接著經無水硫酸鎂乾燥。將混合物過濾及將過濾物在真空中蒸發，得到固體，將其以己烷進一步研製，以供應成為白色固體的 4-溴基-4'-氯基聯苯-3-基硼酸（5.20 公克）。

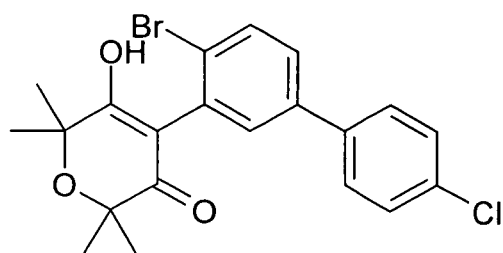
步驟 4：三乙酸 4-溴基-4'-氯基聯苯-3-鉛之製備



將無水氯仿（25 毫升）加入四乙酸鉛（3.76 公克，8.49 毫莫耳）與二乙酸汞（0.27 公克，0.85 毫莫耳）的以氮氣

徹底沖洗之混合物中。將該混合物溫熱至 40°C ，並加入一份 4-溴基-4'-氯基聯苯-3-基硼酸(2.40 公克, 7.72 毫莫耳)，並將混合物在該溫度下攪拌及加熱 4 小時。在冷卻至室溫之後，將混合物以氯仿 (25 毫升) 稀釋，在冰浴中冷卻及快速加入粉末狀無水碳酸鉀 (2.75 公克)，接著以快速攪拌 5 分鐘。將固體以過濾移除及將過濾物濃縮成約其體積的四分之一。加入己烷，以誘發沉澱，並將溶劑在真空中蒸發。以己烷研製，得到三乙酸 4-溴基-4'-氯基聯苯-3-鉛 (3.25 公克)，以未進一步純化而用於下一步驟中。

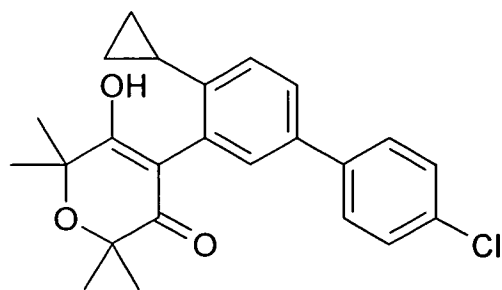
步驟 5：4-(4-溴基-4'-氯基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



將無水氯仿 (40 毫升) 加入 2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (0.75 公克, 4.9 毫莫耳) 與 N,N-二甲胺基吡啶 (2.52 公克, 20.6 毫莫耳) 之混合物中，接著在室溫下攪拌，直到溶解為止。將無水甲苯 (12 毫升) 加入該溶液中，接著加入一份三乙酸 4-溴基-4'-氯基聯苯-3-鉛 (3.25 公克, 5.1 毫莫耳)，並將反應混合物在 80°C 下加熱 2 小時，將混合物冷卻至室溫，以氯仿 (50 毫升) 及 1M 水性氫氯酸 (50 毫升) 稀釋，並將混合物攪拌 5 分鐘。將沉澱以過濾移除，

將兩相分開，並將有機相以鹽水清洗，經無水硫酸鎂乾燥，過濾及將過濾物在真空中蒸發。將殘餘物在矽膠上以快速管柱層析法純化，並將含有所欲化合物的部分合併及蒸發，得到殘餘物，將其以製備性反相 HPLC 進一步純化，得到 4-(4-溴基-4'-氯基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (0.013 公克)。

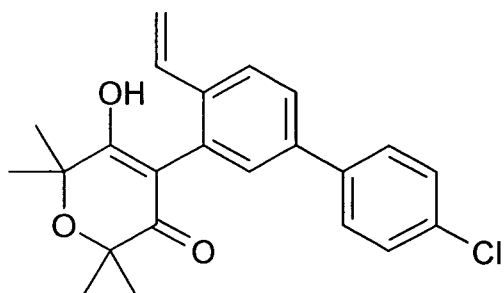
實施例 20：4-(4'-氯基-4-環丙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



將乙酸鈣 (0.010 公克，0.044 毫莫耳) 加入在甲苯 (4 毫升) 與蒸餾水 (0.2 毫升) 之混合的溶劑系統中的 4-(4-溴基-4'-氯基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (0.390 公克，0.90 毫莫耳)、環丙基硼酸 (0.100 公克，1.16 毫莫耳)、磷酸鉀 (0.665 公克，3.14 毫莫耳) 及三環己磷 (0.025 公克，0.09 毫莫耳) 之攪拌溶液中。接著將該混合物在 100°C 下加熱隔夜。在冷卻至室溫之後，將溶液以乙酸乙酯及蒸餾水稀釋，接著經由矽藻土過濾 (以乙酸乙酯 / 蒸餾水額外清洗)。將水相以 2M 水性氫氯酸酸化至 pH 3，接著將有機相分開及將水相再以乙酸乙酯 (x

2) 萃取。將所有的有機部分合併，以鹽水清洗，接著經無水硫酸鎂乾燥及過濾。在真空中濃縮之後，將粗油以製備性反相 HPLC 純化，接著以己烷研製，以供應成為白色固體的 4-(4'-氯基-4-環丙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (0.011 公克)。

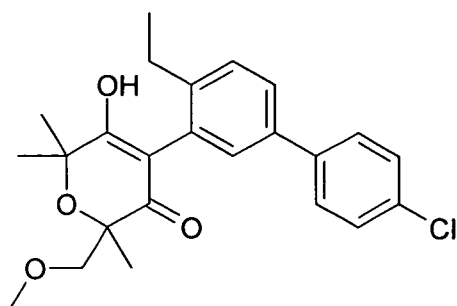
實施例 21：4-(4'-氯基-4-乙烯基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮之製備



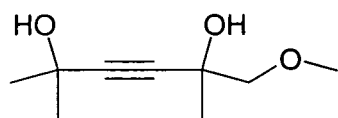
將 4-(4-溴基-4'-氯基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (0.314 公克, 0.72 毫莫耳)、乙烯基硼酸酐吡啶複合物 (0.175 公克, 0.73 毫莫耳)、氫氧化鋰單水合物 (0.177 公克, 4.22 毫莫耳)、1,3-雙(二苯膦基)丙烷 (0.015 公克, 0.036 毫莫耳) 及乙酸鈣 (0.010 公克, 0.044 毫莫耳) 之溶液在 80°C 下在 1,2-二甲氧基乙烷 (5 毫升) 與蒸餾水 (1 毫升) 之混合的溶劑系統中攪拌 3 小時。在冷卻至室溫之後，將混合物經由矽藻土過濾，接著以乙酸乙酯及蒸餾水清洗。將水相以 2M 水性氫氯酸酸化至 pH 3，接著將有機相分開，並將水相再以乙酸乙酯萃取。將所有的有機部分合併，接著經無水硫酸鎂乾燥及過濾。在真空中

濃縮之後，將粗油以製備性反相 HPLC 純化，接著以己烷研製，以供應成為白色固體的 4-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮 (0.038 公克)。

實施例 22：4-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2-甲氧基甲基-2,6,6-三甲基吡喃-3,5-二酮之製備



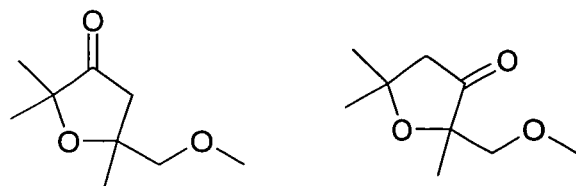
步驟 1：1-甲氧基-2,5-二甲基己-3-炔基-2,5-二醇之製備



將溴化乙基鎂 (37.33 毫升，112 毫莫耳，在二乙醚中的 3M 溶液) 加入在 0-5°C 下的無水二乙醚之溶液中，接著逐滴加入 2-甲基-3-丁炔-2-醇 (4.70 公克，55.87 毫莫耳)。允許混合物溫熱至室溫，接著在該溫度下攪拌 30 分鐘，接著在 40°C 下攪拌，直到氣體放出停止為止 (約 1 小時)。接著將黏的混合物冷卻至室溫，並逐滴加入甲氧基丙酮 (3.78 公克，42.90 毫莫耳)，接著加熱至 40°C 經 1 小時。在冷卻至室溫之後，將懸浮液倒入冰與飽和水性氯化銨之

混合物中，並將產物以二乙醚（2 x 50 毫升）及接著以二氯甲烷（2 x 50 毫升，2 x 100 毫升）萃取。將有機萃取物合併，以鹽水清洗，經無水硫酸鎂乾燥，接著在真空中濃縮，以供應成為澄清油的 1-甲氧基-2,5-二甲基己-3-炔基-2,5-二醇（6.98 公克）。

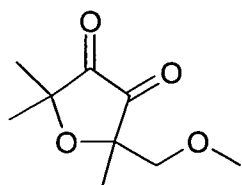
步驟 2：5-甲氧基甲基-2,2,5-三甲基二氫呋喃-3-酮及 2-甲氧基甲基-2,5,5-三甲基二氫呋喃-3-酮之製備



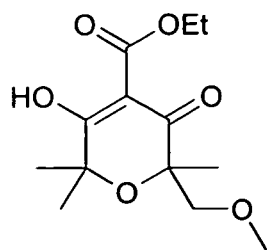
將在甲醇（0.053 毫升）中的三氯乙酸（0.02 公克，0.122 毫莫耳）之溶液加入氧化汞（0.05 公克，0.231 毫莫耳）中，接著加入三氟化硼-二乙醚化物（0.053 毫升，0.37 毫莫耳）。將混合物短暫攪拌，接著加熱，直到產生乳白糊狀物為止（約 5 分鐘），接著以額外的甲醇（1 毫升）稀釋。接著將在甲醇（1 毫升）中的 1-甲氧基-2,5-二甲基己-3-炔基-2,5-二醇（1.22 公克，7.09 毫莫耳）之溶液逐滴加入該懸浮液中，並將所得混合物在 50℃ 下加熱 3 小時。在冷卻至室溫之後，將反應混合物經由矽藻土過濾（以額外的甲醇清洗），接著在 40℃ / 150 毫巴下濃縮，得到粗油。將該物質以二乙醚進一步稀釋，經固體碳酸氫鈉攪拌，接著過濾及在 40℃ / 150 毫巴下濃縮，以供應成為棕色油的 5-甲氧基甲基-2,2,5-三甲基二氫呋喃-3-酮與 2-甲氧基甲基-

2,5,5-三甲基二氫呋喃-3-酮之混合物（0.73 公克），以未進一步純化而用於下一步驟中。

步驟 3：2-甲氧基甲基-2,5,5-三甲基呋喃-3,4-二酮之製備

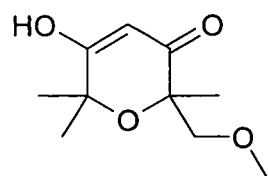


將在濕性二噁烷（17 毫升，含有以體積計 0.5% 之蒸餾水）中的二氧化硒（2.10 公克，18.91 毫莫耳）之攪拌溶液加熱至 100°C，在此時，經 40 分鐘逐滴加入在濕性二噁烷（5 毫升，含有以體積計 0.5% 之蒸餾水）中的 5-甲氧基甲基-2,2,5-三甲基二氫呋喃-3-酮與 2-甲氧基甲基-2,5,5-三甲基二氫呋喃-3-酮（2.55 公克，14.82 毫莫耳）的第二種（混合）溶液，接著在該溫度下進一步加熱 3 小時。在冷卻至室溫之後，將混合物經由矽藻土過濾（以二乙醚清洗），接著將溶劑在 40°C / 50 毫巴下移除，得到黏的紅-棕色油。該物質以減壓蒸餾而純化，以供應成為棕紅色油的 2-甲氧基甲基-2,5,5-三甲基呋喃-3,4-二酮（2.15 公克）。
 步驟 4：2-甲氧基甲基-2,6,6-三甲基-3,5-二酮基四氫吡喃-4-羧酸乙酯之製備



將在第三丁基甲醚（8 毫升）中的 2-甲氧基甲基-2,5,5-三甲基吡喃-3,4-二酮（2.15 公克，11.56 毫莫耳）的第二種溶液小心地加入在 8°C 下的氯化鋅溶液（11.80 毫升，11.80 毫莫耳，在二乙醚中的 1M 溶液）中。允許該混合物溫熱至 15°C，在該階段，經 1 小時逐滴加入在第三丁基甲醚（6 毫升）中的重氮乙酸乙酯（1.35 公克，11.84 毫莫耳）之溶液，使內部溫度維持在 21°C 以下，在室溫下再攪拌隔夜。將混合物以第三丁基甲醚（15 毫升）稀釋，以 1M 氫氯酸（3 x 20 毫升）清洗及以 1M 氫氧化鈉（2 x 100 毫升）萃取。將固體氯化鈉加入該水相中，接著以濃縮氫氯酸酸化及接著將混合物以二氯甲烷萃取。將有機萃取物經無水硫酸鎂乾燥，過濾及將過濾物在真空中濃縮，以供應成為粉紅色油的 2-甲氧基甲基-2,6,6-三甲基-3,5-二酮基四氫吡喃-4-羧酸乙酯（2.11 公克）。

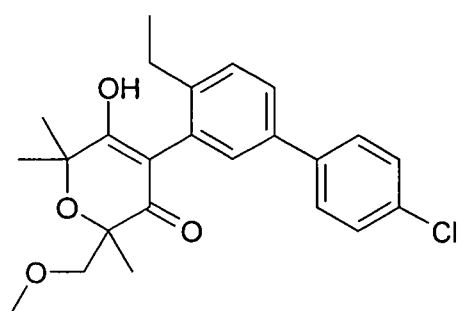
步驟 5：2-甲氧基甲基-2,6,6-三甲基吡喃-3,5-二酮之製備



將 20% 水性硫酸（2.5 毫升）加入在二噁烷（2.5 毫升）

中的 2-甲氧基甲基-2,6,6-三甲基-3,5-二酮基四氫吡喃-4-羧酸乙酯 (2.11 公克, 7.72 毫莫耳) 之溶液中, 並將混合物在 110°C 下加熱 2.5 小時。將混合物冷卻至室溫, 以飽和鹽水稀釋及以二氯甲烷萃取。將粗物質萃取至水性氫氧化鈉中, 將水相以二氯甲烷清洗, 接著以濃縮氫氯酸酸化及萃取至二氯甲烷 (2 x 15 毫升) 中。將有機相在真空中濃縮, 得到粗油, 將其在矽膠上以快速管柱層析法 (7.5 : 1.5 之比的異己烷 / 二乙醚) 純化, 以供應成為粉紅色固體的 2-甲氧基甲基-2,6,6-三甲基吡喃-3,5-二酮 (0.250 公克)。

步驟 6: 4-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2-甲氧基甲基-2,6,6-三甲基吡喃-3,5-二酮之製備

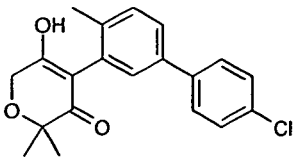
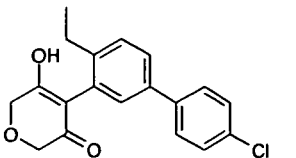
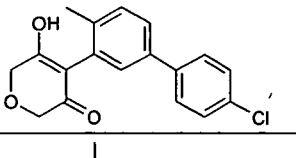
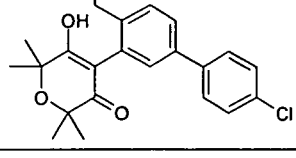
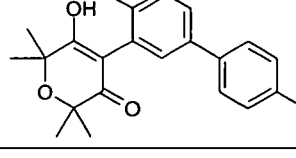
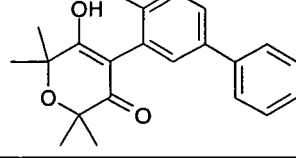
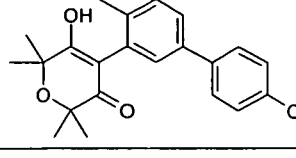
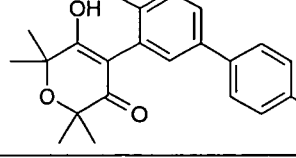
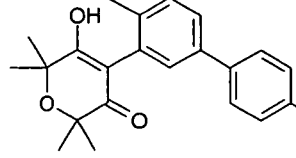
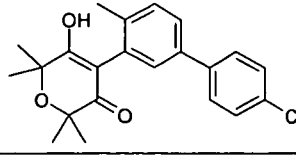


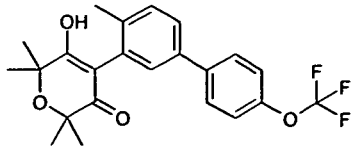
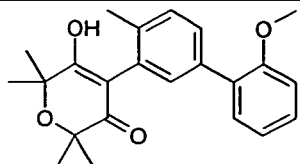
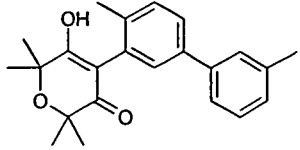
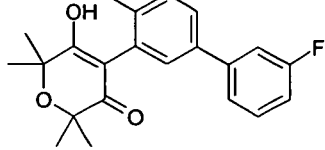
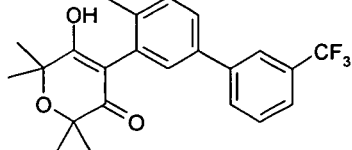
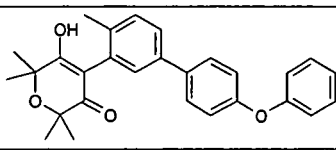
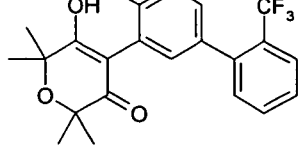
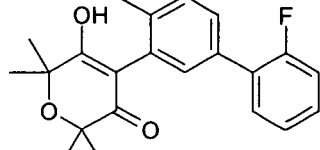
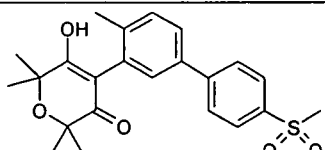
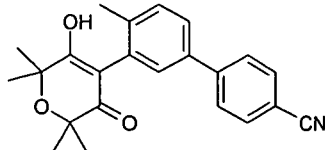
將三乙酸 4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基 (0.465 公克, 0.775 毫莫耳) 以一份加入在無水氯仿 (7.5 毫升) 與無水甲苯 (1.75 毫升) 之混合的溶劑系統中的 2-甲氧基甲基-2,6,6-三甲基吡喃-3,5-二酮 (0.141 公克, 0.705 毫莫耳) 與 N,N-二甲胺基吡啶 (0.43 公克, 3.52 毫莫耳) 之混合物中, 並將混合物在 80°C 下加熱 2 小時。允許混合物冷卻至室溫, 以二氯甲烷及稀釋的水性氫氯酸稀釋, 並攪拌 5 分鐘, 接

著經由矽藻土過濾，以移除無機殘餘物（以溶劑額外清洗）。將有機部分合併，經無水硫酸鎂乾燥，過濾及將過濾物在真空中濃縮。將殘餘物在矽膠上以管柱層析法（4：1 之比的己烷 / 乙酸乙酯）純化。將含有所欲產物之部分合併及在真空中蒸發。以己烷研製，以供應成為白色固體的 4-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2-甲氧基甲基-2,6,6-三甲基吡喃-3,5-二酮（0.070 公克）。

在表 A 中的額外化合物係以類似的步驟從適當的原料所製備。應注意本發明的某些化合物在用於獲得 ^1H nmr 數據的條件下以阻轉異構物（atropisomers）之混合物或上述註明之其它異構物存在。當出現該異構物時，則特徵化數據係以各個異構物，異構物 A 及異構物 B 報告，其一起代表阻轉異構物之混合物，或其他異構物，在特定溶劑中於周圍溫度下存在。

表 A

化合物 編號	結構	^1H nmr (CDCl_3 , 除非有另外陳述) 或其他的 物理數據
A-1		δ 7.50-7.44 (m, 3H, 異構物 A 和 B), 7.40-7.32 (m, 3H, 異構物 A 和 B), 7.25 (m, 1H, 異構物 A 和 B), 5.86 (br. s, 0.58H, 異構物 A), 5.78 (br. s, 0.42H, 異構物 B), 4.56 (br. s, 1.16H, 異構物 A), 4.33 (br. s, 0.84, 異構物 B) 2.14 (s, 3H, 異構物 A 和 B), 1.57 (br. s, 3H, 異構物 A 和 B), 1.45 (br. s, 3H, 異構物 A 和 B).
A-2		δ 7.50 (dd, 1H), 7.45 (m, 2H), 7.37 (d, 1H), 7.37 (m, 2H), 7.21 (d, 1H), 4.33 (br. q, 4H), 2.48 (q, 2H), 1.12 (t, 3H).
A-3		δ 7.52 (dd, 1H), 7.50 (m, 2H), 7.40 (m, 2H), 7.39 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 4.39 (m, 4H), 2.20 (s, 3H).
A-4		δ 7.55 (dd, 1H), 7.52-7.50 (m, 2H), 7.42 (d, 1H), 7.40-7.38 (m, 2H), 7.24 (d, 1H), 5.61 (br. s, 1H), 2.53-2.42 (m, 2H), 1.62 (br. s, 6H), 1.51 (app. d, 6H), 1.15 (t, 3H).
A-5		δ 7.51-7.49 (m, 3H), 7.40-7.38 (m, 3H), 7.27 (d, 1H), 5.63 (s, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.62 (br. S, 6H), 1.51 (app. d, 6H).
A-6		δ 7.58 (m, 2H), 7.55 (dd, 1H), 7.42 (m, 2H), 7.41 (d, 1H), 7.34 (t, 1H), 7.31 (d, 1H), 5.70 (br. s, 1H), 2.19 (s, 3H), 1.60 (d, 6H), 1.51 (d, 6H).
A-7		δ 7.50 (dd, 1H), 7.50 (m, 2H), 7.36 (d, 1H), 7.27 (d, 1H), 6.97 (m, 2H), 5.71 (br. s, 1H), 3.83 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.58 (d, 6H), 1.50 (d, 6H).
A-8		δ 7.59 (dd, 1H), 7.51 (m, 2H), 7.40 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.30 (m, 2H), 5.81 (br. s, 1H), 2.45 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.68 (d, 6H), 1.57 (d, 6H).
A-9		δ 7.50 (dd, 1H), 7.50 (m, 2H), 7.39 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.10 (m, 2H), 6.05 (br. s, 1H), 2.17 (s, 3H), 1.60 (br. s, 6H), 1.51 (br. d, 6H).
A-10		δ 7.69 (s, 4H), 7.55 (dd, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.31 (d, 1H), 5.60 (s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.62 (s, 6H), 1.50 (d, 6H).

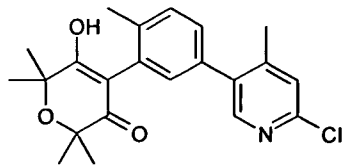
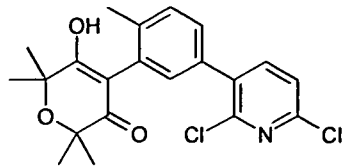
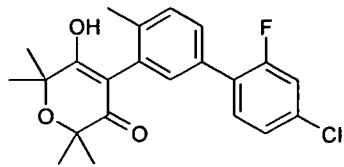
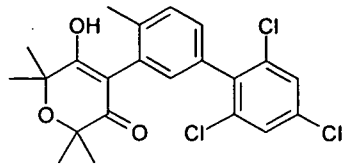
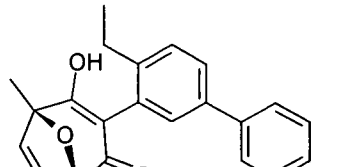
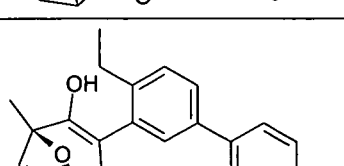
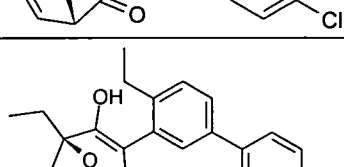
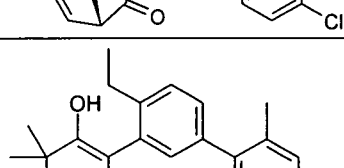
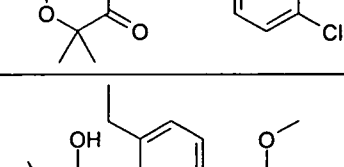
A-11		δ 7.59 (m, 2H), 7.51 (dd, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.27 (m, 2H), 7.27 (d, 1H), 5.60 (s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.62 (s, 6H), 1.50 (d, 6H).
A-12		δ 7.49 (dd, 1H), 7.30-7.37 (m, 3H), 7.22 (d, 1H), 7.01 (t, 1H), 6.99 (d, 1H), 6.00 (br. s, 1H), 3.80 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.60 (s, 6H), 1.49 (s, 6H).
A-13		δ 7.52 (dd, 1H), 7.37 (m, 3H), 7.32 (d, 1H), 7.29 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 5.90 (br. s, 1H), 2.41 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.61 (br. s, 6H), 1.50 (br. s, 6H).
A-14		δ 7.41-7.32 (m, 3H), 7.30-7.23 (m, 2H), 7.29 (d, 1H), 7.03 (m, 1H), 5.76 (br. s, 1H), 2.19 (s, 3H), 1.61 (br. s, 6H), 1.50 (br. s, 6H).
A-15		δ 7.80 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.56 (t, 1H), 7.56 (dd, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 5.69 (br. s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.61 (d, 6H), 1.51 (s, 6H).
A-16		δ 7.53 (m, 2H), 7.51 (dd, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.34 (m, 2H), 7.27 (d, 1H), 7.12 (t, 1H), 7.05 (m, 4H), 5.77 (br. s, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.61 (br. s, 6H), 1.51 (br. d, 6H).
A-17		δ 7.73 (d, 1H), 7.57 (t, 1H), 7.47 (t, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.30 (dd, 1H), 7.09 (s, 1H), 5.87 (br. s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.60 (d, 6H), 1.51 (s, 3H), 1.49 (s, 3H).
A-18		δ 7.50 (dt, 1H), 7.44 (dt, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.31 (m, 1H), 7.26 (d, 1H), 7.20 (dt, 1H), 7.15 (m, 1H), 6.01 (br. s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.62 (s, 6H), 1.50 (d, 6H).
A-19		δ 7.95 (m, 2H), 7.72 (m, 2H), 7.54 (dd, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.31 (d, 1H), 5.85 (br. s, 1H), 3.09 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.58 (br. s, 12H).
A-20		δ 7.69 (m, 4H), 7.54 (dd, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 5.60 (br. s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.61 (s, 6H), 1.50 (d, 6H).

A-21		δ 7.55 (dd, 1H), 7.51 (m, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.39 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 5.69 (s, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.61 (s, 6H), 1.50 (d, 6H), 1.35 (s, 9H).
A-22		δ 7.84 (d, 1H), 7.80 (dd, 1H), 7.61 (dd, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.51 (m, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 5.70 (s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.62 (d, 6H), 1.50 (s, 6H).
A-23		δ 7.44-7.30 (m, 6H), 7.20 (d, 1H), 6.01 (br. s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.60 (d, 6H), 1.50 (d, 6H).
A-24		δ 7.47 (dd, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.36 (dd, 1H), 7.29 (m, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.21 (m, 1H), 5.60 (s, 1H), 2.19 (s, 3H), 1.61 (s, 6H), 1.50 (d, 6H).
A-25		δ 7.50 (dd, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.26 (d, 1H), 7.09 (m, 2H), 6.78 (m, 1H), 5.64 (s, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.62 (d, 6H), 1.50 (s, 6H).
A-26		δ 7.57-7.48 (m, 3H, 異構物 A 和 B), 7.43-7.37 (m, 3H, 異構物 A 和 B), 7.27 (ddd, 0.5H, 異構物 A 或 B), 7.22 (ddd, 0.5H, 異構物 A 或 B), 5.59 (app. d, 0.5H, 異構物 A 或 B), 5.48 (app. d, 0.5H, 異構物 A 或 B), 4.77 (m, 0.5H, 異構物 A 或 B), 4.45 (m, 0.5H, 異構物 A 或 B), 2.55-2.36 (m, 2H, 異構物 A 和 B), 1.63-1.45 (m, 9H, 異構物 A 和 B), 1.17-1.12 (m, 3H, 異構物 A 和 B).
A-27		δ 7.49-7.38 (m, 3H), 7.21 (s, 1H), 6.98-6.88 (m, 2H), 5.70 (s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.61 (s, 6H), 1.50 (d, 6H).
A-28		δ 8.00 (s, 2H), 7.85 (s, 1H), 7.58 (dd, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.31 (d, 1H), 5.56 (s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.63 (app. d, 6H), 1.55 (s, 3H), 1.50 (s, 3H).
A-29		δ 7.5-7.3 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 7.23 (d, 0.59H, 異構物 A), 7.06 (d, 0.41H, 異構物 B), 5.8 (app. br. d, 1H, 異構物 A 和 B), 4.79 (app. d, 0.59H, 異構物 A), 4.60 (app. d, 0.41H, 異構物 B), 2.6-1.8 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 1.59 (s, 1.77H, 異構物 A), 1.51 (s, 1.23H, 異構物 B), 1.09 (t, 1.23H, 異構物 B), 1.04 (t, 1.77H, 異構物 A).

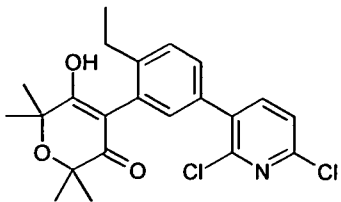
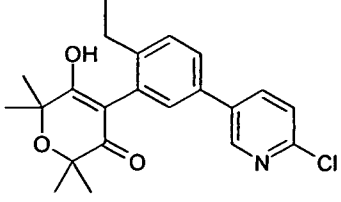
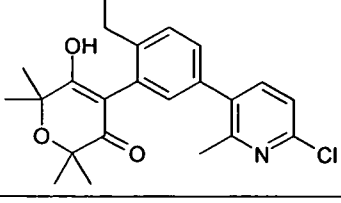
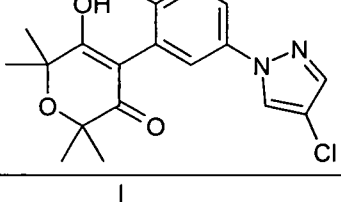
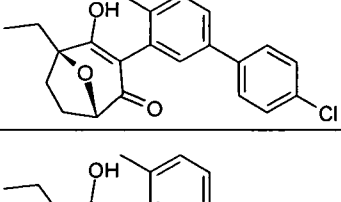
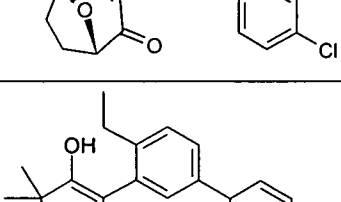
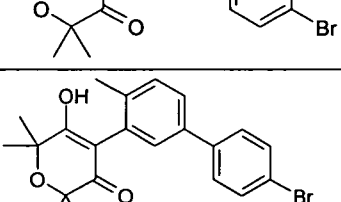
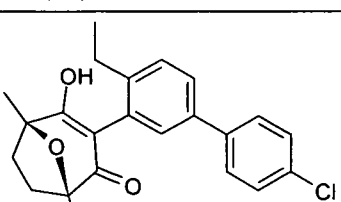
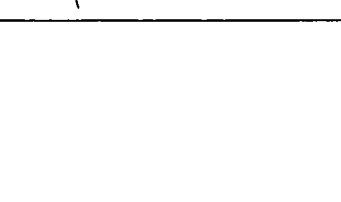
A-30		δ 7.46-7.27 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 7.25 (d, 0.55H, 異構物 A), 7.1 (d, 0.45H, 異構物 B), 5.8 (app. br. d, 0.45H, 異構物 B), 5.64 (app. br. s, 0.55H, 異構物 A), 4.79 (app. d, 0.55H, 異構物 A), 4.6 (app. dd, 0.45H, 異構物 B), 2.5-2.3 (m, 1H, 異構物 A 和 B), 2.13 (s, 1.35H, 異構物 B), 2.02 (s, 1.65H, 異構物 A), 2.1-1.8 (m, 3H, 異構物 A 和 B), 1.61 (s, 1.35H, 異構物 B), 1.52 (s, 1.65H, 異構物 A).
A-31		δ 7.47 (dd, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.19 (dd, 2H), 5.55 (s, 1H), 2.19 (s, 3H), 1.62 (d, 6H), 1.50 (s, 6H).
A-32		δ 8.60 (s, 2H), 7.28 (br. s, 1H), 7.28 (br. s, 1H), 7.24 (br. s, 1H), 4.04 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.63 (d, 6H), 1.50 (s, 6H).
A-33		δ 7.65 (d, 1H), 7.52 (dt, 1H), 7.45-7.38 (m, 2H), 7.36-7.30 (m, 2H), 7.17 (d, 1H), 5.88-5.82 (m, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.55 (br. s, 12H).
A-34		δ 7.57-7.38 (m, 5H, 異構物 A 和 B), 7.23-7.19 (m, 2H, 異構物 A 和 B), 5.60-5.48 (m, 1H, 異構物 A 和 B), 2.57-2.39 (m, 2H, 異構物 A 和 B), 2.05-1.91 (m, 1H, 異構物 A 或 B), 1.80-1.68 (m, 1H, 異構物 A 或 B), 1.65-1.46 (m, 9H, 異構物 A 和 B), 1.18-1.13 (m, 3H, 異構物 A 和 B), 1.01-0.93 (m, 3H, 異構物 A 和 B).
A-35		δ 7.57-7.38 (m, 5H), 7.23-7.18 (m, 2H), 5.57-5.46 (m, 1H), 2.57-2.42 (m, 2H), 2.07-1.61 (m, 4H), 1.64-1.41 (m, 6H), 1.19-1.13 (m, 3H), 1.04-0.94 (m, 6H).
A-36		δ 7.57 (dd, 1H), 7.50 (d, 2H), 7.43 (d, 1H), 7.39 (d, 2H), 7.27 (m, 1H), 5.66 (br. s, 1H), 4.53-4.31 (m, 2H), 2.49 (m, 2H), 2.19-1.74 (m, 8H), 1.15 (t, 3H).
A-37		δ 7.53-7.45 (m, 3H, 異構物 A 和 B), 7.40-7.34 (m, 3H, 異構物 A 和 B), 7.26 (m, 1H, 異構物 A 和 B), 6.04 (br. s, 0.61H, 異構物 A), 5.94 (br. s, 0.39H, 異構物 B), 4.54 (s, 1.22H, 異構物 A), 4.32 (s, 0.78H, 異構物 B), 3.90-3.81 (m, 2H, 異構物 A 和 B), 3.80-3.71 (m, 2H, 異構物 A 和 B), 2.30-2.03 (m, 2H, 異構物 A 和 B), 2.16 (s, 1.17H, 異構物 B), 2.14 (s, 1.83H, 異構物 A), 1.95-1.72 (m, 2H, 異構物 A 和 B).

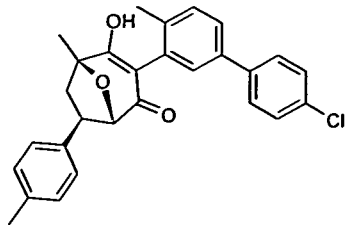
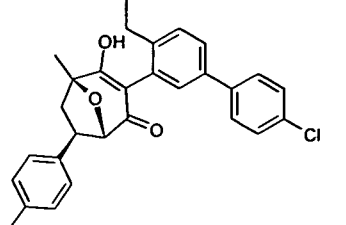
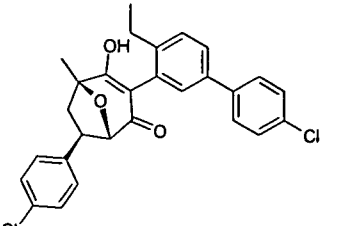
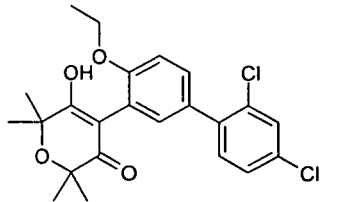
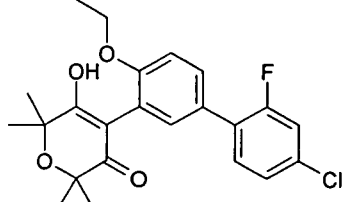
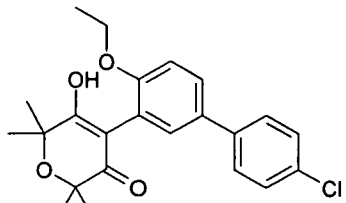
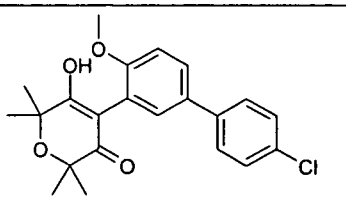
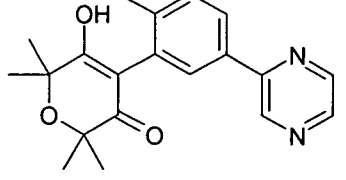
A-38		m.p. 165-167 °C; LC-MS (ES+) 353 (M+H) ⁺
A-39		δ 7.14-7.56 (m, 7H, 異構物 A 和 B), 6.1 (br. s, 1H, 異構物 A 和 B), 4.7 (d, 1H, 異構物 A), 4.6 (d, 1H, 異構物 II), 2.1-2.6 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 2.0(s, 3H, 異構物 A 和 B), 1.66 (s, 3H, 異構物 A 和 B), 1.16 (t, 3H, 異構物 A) 1.11 (s, 3H, 異構物 B).
A-40		δ 7.16-7.48 (m, 7H), 5.65(br. s, 1H), 2.0-2.2(m, 7H), 1.64 (s, 3H), 1.55 (s, 3H).
A-41		δ 8.10 (d, 1H), 7.94 (dt, 1H), 7.24-7.32 (m, 3H), 6.94 (dd, 1H), 2.19 (s, 3H), 1.65 (app. d, 6H), 1.51 (app. d, 6H).
A-42		δ 7.66 (dd, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 5.52 (br. s, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.63 (app d, 6H), 1.52 (s, 6H), 1.15, (t, 3H).
A-43		δ 7.56 (dd, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 5.52 (br. s, 1H), 2.48 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.51 (s, 6H), 1.15 (t, 3H).
A-44		δ 7.55 (dd, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.23 (d, 1H), 5.58 (br. s, 1H), 2.48 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 1.63 (s, 6H), 1.52 (s, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-45		δ 7.48 (d, 1H), 7.43 (m, 2H), 7.30 (m, 2H), 7.13 (d, 1H), 5.71 (br. s, 1H), 2.55-2.44 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.49 (app. d, 6H), 1.17 (t, 3H).
A-46		δ 7.12 (br. s, 4H), 6.91 (br. m, 3H), 6.52 (br. S, 1H), 2.04 (s, 3H), 1.49 (br. d, 12H).

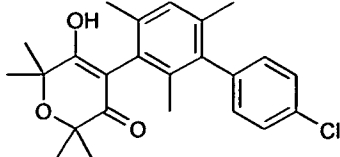
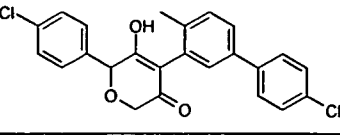
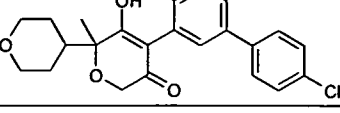
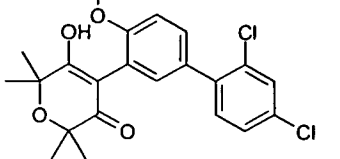
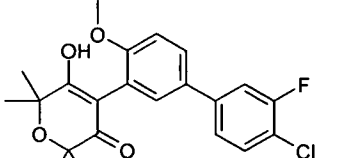
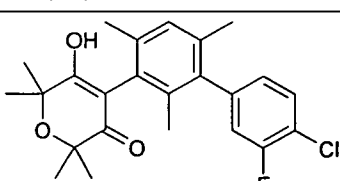
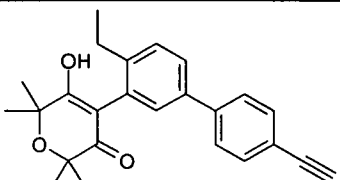
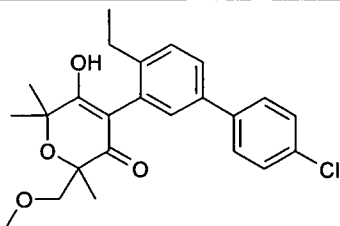
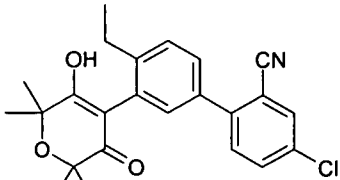
A-47		δ 7.49 (dd, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.23 (d, 1H), 5.65 (br. s, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.63 (s, 6H), 1.51 (s, 6H).
A-48		δ 7.67 (dd, 1H), 7.50 (m, 2H), 7.40 (m, 2H), 7.24 (d, 1H), 5.54 (br. s, 1H), 2.19 (s, 3H), 1.63 (app. d, 6H), 1.52 (app. d, 6H).
A-49		δ 7.48 (dd, 1H), 7.43 (m, 2H), 7.30 (m, 2H), 7.15 (d, 1H), 5.78 (br. s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.60 (app. d, 6H), 1.50 (app. d, 6H).
A-50		δ 7.87 (d, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 5.52 (br. s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.63 (app. d, 6H), 1.51 (s, 6H).
A-51		δ 7.36 (dd, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.19 (d, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.03 (d, 1H), 5.64 (br. s, 1H), 2.27 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.62 (app. d, 6H), 1.50 app. d, 6H).
A-52		δ 7.86, (d, 1H), 7.67 (dd, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.51 (dd, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.27 (d, 1H), 5.64 (br. s, 1H), 2.19 (s, 3H), 1.63 (s, 6H), 1.52 (s, 6H).
A-53		δ 7.54-7.30 (m, 6H), 5.90 (br. s, 1H), 2.52 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 1.68 (s, 6H), 1.57 (s, 6H).
A-54		δ 8.52 (s, 1H), 7.84 (dd, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.24 (s, 1H), 5.90 (br. s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.63 (s, 6H), 1.51 (s, 1H).
A-55		δ 7.72 (d, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.26 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 5.71 (br. s, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.61 (app. d, 6H), 1.50 (app. d, 6H).
A-56		δ 7.52 (dd, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.05 (s, 1H), 5.53 (br. s, 1H), 2.52 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.63 (app. d, 6H), 1.51 (app. d, 6H).

A-57		δ 7.52 (s, 1H), 7.18 (s, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.03, (s, 1H), 6.97 (d, 1H), 5.53 (br. s, 1H), 2.30 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 1.65 (d, 6H), 1.51 (d, 6H).
A-58		δ 7.67 (dd, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.18 (d, 1H), 5.75 (br. s, 1H), 2.22 (s, 3H), 1.62 (app. d, 6H), 1.50 (app. d, 6H).
A-59		δ 7.47 (dd, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.22 (dd, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.17 (d, 1H), 5.75 (br. s, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.62 (s, 6H), 1.51 (d, 6H).
A-60		δ 7.42 (app. dd, 2H), 7.26 (m, 1H), 7.21 (dd, 1H), 6.99 (d, 1H), 5.74 (br. s, 1H), 2.23 (s, 3H), 1.59 (app. d, 6H), 1.51 (app. d, 6H).
A-61		δ 7.5-7.28 (m, 8H), 6.4 (dd, 1H), 6.2 (dd, 1H), 5.44 (s, 1H), 5.39 (dd, 1H), 2.5 (m, 2H), 1.73 (s, 3H), 1.17 (t, 3H).
A-62		δ 7.46-7.3 (m, 7H), 6.43 (dd, 1H), 6.25 (d, 1H), 5.45 (s, 1H), 5.39 (d, 1H), 2.47 (m, 2H), 1.73 (s, 3H), 1.14 (t, 3H).
A-63		δ 7.46-7.3 (m, 7H), 6.4 (dd, 1H), 6.2 (d, 1H), 5.43 (s, 1H), 5.4 (m, 1H), 2.45 (m, 2H), 2.1 (q, 2H), 1.15 (t, 3H), 1.05 (t, 3H).
A-64		δ 7.40 (d, 1H), 7.30 (dd, 1H), 7.26 (m, 1H), 7.20 (dd, 1H), 7.16 (d, 1H), 6.99 (d, 1H), 5.69 (br. s, 1H), 2.55-2.43 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.60 (app. d, 6H), 1.49 (app. d, 6H), 1.17 (t, 3H).
A-65		δ 7.49 (dd, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.02 (dd, 1H), 6.95 (s, 1H), 3.82 (s, 3H), 2.45 (br., 2H), 1.56 (br., 12H), 1.15 (t, 3H).

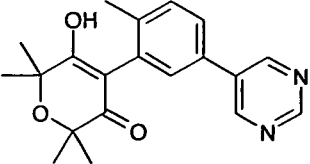
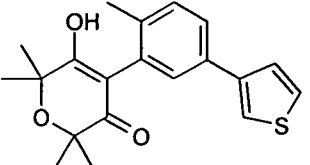
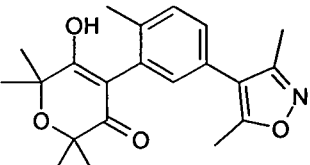
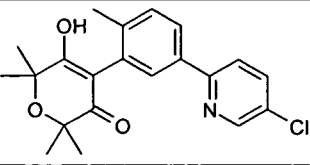
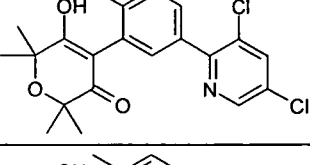
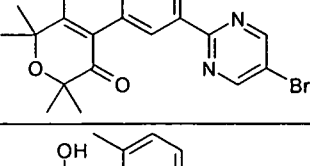
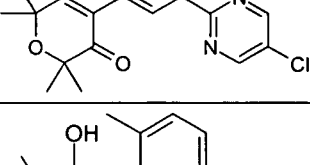
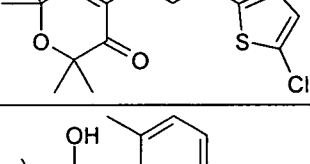
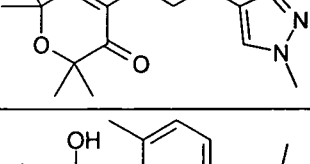
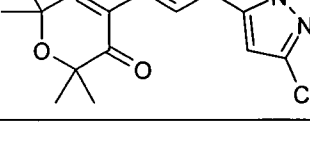
A-66		δ 7.52 (dd, 1H), 7.44-7.36 (m, 2H), 7.21-7.16 (m, 3H), 5.77 (br. s, 1H), 2.54-2.43 (m, 2H), 1.61 (s, 6H), 1.49 (app. d, 6H), 1.15 (t, 3H).
A-67		δ 7.86 (d, 1H), 7.67 (dd, 1H), 7.57 (m, 2H), 7.46 (d, 1H), 7.25 (m, 1H), 5.60 (br. s, 1H), 2.55-2.43 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.51 (s, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-68		δ 8.02 (s, 1H), 7.62 (dd, 1H), 7.57 (dd, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.27 (s, 1H), 6.61 (br. s, 2H), 2.48 (m, 2H), 1.56 (br., 12H), 1.15 (t, 3H).
A-69		δ 7.84 (s, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.54 (m, 2H), 7.46 (d, 1H), 7.23 (s, 1H), 5.68 (br. s, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.52 (s, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-70		δ 7.46 (dd, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.24 (d, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.01 (dd, 1H), 6.94 (d, 1H), 3.80 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.62 (s, 6H), 1.51 (app. d, 6H).
A-71		δ 7.48 (app. d, 1H), 7.44-7.40 (m, 2H, 異構物 A 和 B), 7.29 (m, 2H, 異構物 A 和 B), 7.15-7.10 (m, 1H, 異構物 A 和 B), 5.80 (app. d, 0.5H, 異構物 A 或 B), 5.66 (app. d, 0.5H, 異構物 A 或 B), 5.76 (m, 0.5H, 異構物 A 或 B), 4.44 (m, 0.5H, 異構物 A 或 B), 2.58-2.36 (m, 2H, 異構物 A 和 B), 1.62-1.44 (m, 9H, 異構物 A 和 B), 1.19-1.14 (m, 3H, 異構物 A 和 B).
A-72		δ 7.76 (s, 1H), 7.57 (dd, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.35 (m, 2H), 7.05 (s, 1H), 5.82 (br. s, 1H), 2.54 (m, 2H), 1.66 (br., 12H), 1.22 (t, 3H).
A-73		δ 7.82 (s, 1H), 7.58 (br., 1H), 7.33 (d, 1H), 7.24 (s, 1H), 7.17 (dd, 1H), 7.04 (s, 1H), 2.59 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 1.63 (br., 6H), 1.53 (br., 6H), 1.21 (t, 3H).
A-74		δ 7.52-7.45 (m, 3H), 7.30 (dd, 1H), 7.02 (s, 1H), 5.86 (br. s, 1H), 2.57 (m, 2H), 1.62 (d, 6H), 1.53 (d, 6H), 1.23 (t, 3H).

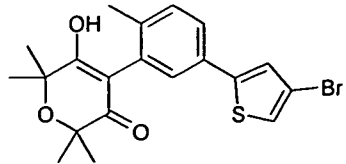
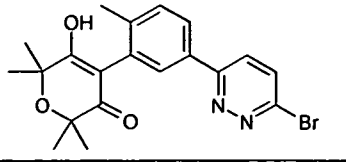
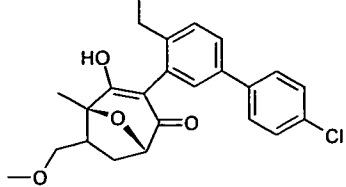
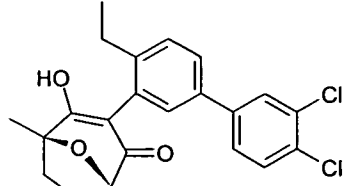
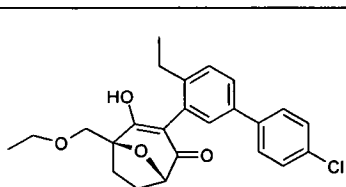
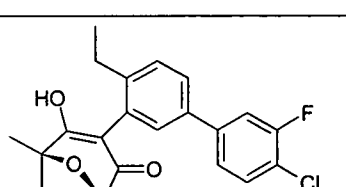
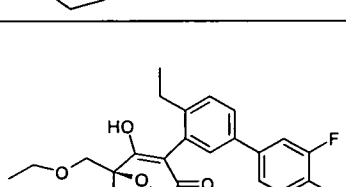
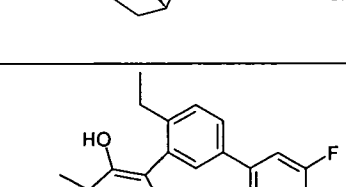
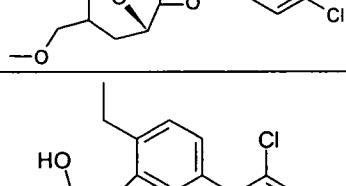
A-75		δ 7.68 (d, 1H), 7.43 (s, 2H), 7.33 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.81 (br. s, 1H), 2.51 (m, 2H), 1.58 (br., 6H), 1.48 (br., 6H), 1.17 (t, 3H).
A-76		δ 8.52 (s, 1H), 7.84 (dd, 1H), 7.46 (dd, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.23 (s, 1H), 2.48 (t, 2H), 1.58 (br., 6H), 1.47 (br., 6H), 1.14 (t, 3H).
A-77		δ 7.51 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.32 (dd, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.01 (s, 1H), 5.61 (br. s, 1H), 2.52 (s, 3H), 2.50 (m, 2H), 1.61 (d, 6H), 1.48 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).
A-78		δ 7.81 (s, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.44 (dd, 1H), 7.32-7.30 (m, 2H), 2.10 (s, 3H), 1.54 (s, 6H), 1.42 (s, 6H).
A-79		δ 7.6-7.1 (m, 7H), 4.7 (br. s, 1H), 1.8-2.5 (m, 8H), 1.2 (t, 3H), 1.1 (t, 3H).
A-80		δ 7.47-7.17 (m, 7H, 異構物 A 和 B), 5.9 (br. s, 1H, 異構物 A), 5.8 (br. s, 1H, 異構物 B), 4.8 (dd, 1H, 異構物 A), 4.7 (d, 1H, 異構物 B), 2.1 (s, 3H, 異構物 A 和 B), 1.8-2.5 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 1.1 (t, 3H, 異構物 B), 1.0 (t, 3H, 異構物 A).
A-81		δ 7.54 (m, 3H), 7.42 (m, 3H), 7.24 (s, 1H), 5.63 (s, 1H), 2.47 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.50 (s, 6H), 1.15 (t, 3H).
A-82		δ 7.55 (d, 2H), 7.50 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.35 (d, 2H), 7.27 (s, 1H), 5.60 (br. s, 1H), 2.18 (s, 3H), 1.63 (s, 6H), 1.51 (app. d, 6H).
A-83		δ 7.55-7.14 (m, 7H, 異構物 A 和 B), 5.7 (br. s, 1H, 異構物 B), 5.6 (br. s, 異構物 A), 2.6-2.1 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 1.62 (s, 6H, 異構物 A 和 B), 1.2 (m, 3H, 異構物 B), 1.1 (m, 3H, 異構物 A).

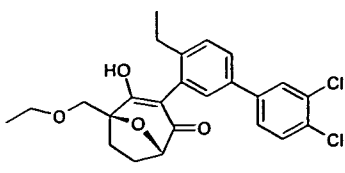
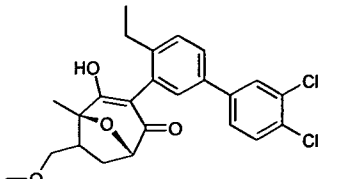
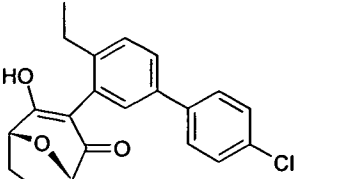
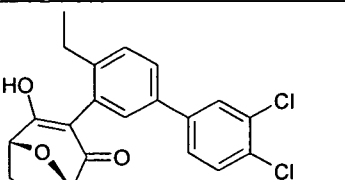
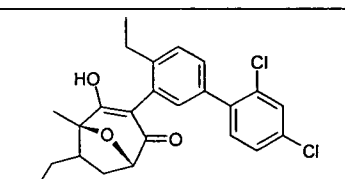
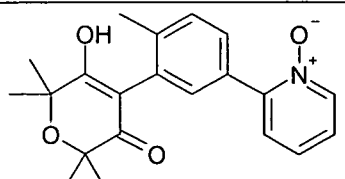
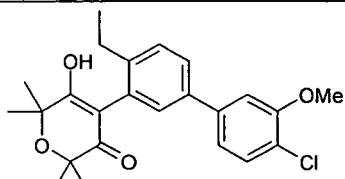
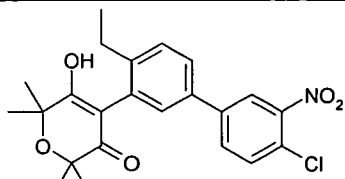
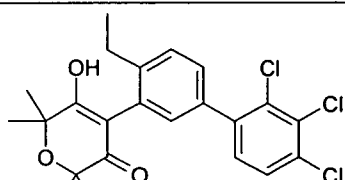
A-84		δ 7.51-7.46 (m, 4H), 7.40-7.37 (m, 4H), 7.1 (m, 3H), 6.25 (br. s, 1H), 4.7 (s, 1H), 3.57-3.47 (m, 1H), 2.9-2.6 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 1.68 (s, 3H).
A-85		δ 7.55-7.16 (m, 11H), 5.8 (br. s, 1H), 4.7 (d, 1H), 3.6-3.4 (m, 1H), 2.66-2.4 (m, 4H), 2.35 (s, 3H), 1.7 (s, 3H), 1.12 (m, 3H).
A-86		δ 7.55-7.25 (m, 11H), 5.95 (br. s, 1H), 4.7 (d, 1H), 3.6-3.35 (m, 1H), 2.85-2.4 (m, 4H), 1.66 (d, 3H), 1.15 (m, 3H).
A-87		甲醇- d_4 δ 7.50 (m, 1H), 7.40 (m, 3H), 7.10 (m, 1H), 7.05 (d, 1H), 4.05 (q, 2H), 1.50 (s, 12H), 1.32 (t, 3H).
A-88		甲醇- d_4 δ 7.50 (m, 2H), 7.25 (m, 2H), 7.20 (m, 1H), 7.05 (d, 1H), 4.05 (q, 2H), 1.50 (s, 12H), 1.32 (t, 3H).
A-89		甲醇- d_4 δ 7.55 (m, 3H), 7.38 (m, 2H), 7.28 (m, 1H), 7.05 (d, 1H), 4.05 (q, 2H), 1.50 (s, 12H), 1.30 (t, 3H).
A-90		δ 7.57-7.53 (d, 1H), 7.5-7.46 (dd, 2H), 7.39-7.36 (dd, 2H), 7.28-7.26 (d, 1H), 7.09-6.9 (d, 1H), 3.9 (s, 3H), 1.5-1.7 (m, 12H).
A-91		甲醇- d_4 δ 9.10 (s, 1H), 8.65 (m, 1H), 8.50 (d, 1H), 7.95 (dd, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 2.20 (s, 3H), 1.52 (s, 12H).

A-92		δ 7.39 (m, 2H), 7.11 (dd, 1H), 7.06 (s, 1H), 7.04 (dd, 1H), 5.51 (br. s, 1H), 2.11 (s, 3H), 1.99 (s, 3H), 1.76 (s, 3H), 1.60 (d, 6H), 1.49 (d, 6H).
A-93		δ 7.52-7.22 (m, 11H, 異構物 A 和 B), 5.28 和 5.26 (br. 每一 s, 1H 一起, 異構物 A 和 B), 4.36 (m, 2H, 異構物 A 和 B), 2.19 和 2.16 (每一 s, 3H 一起, 異構物 A 和 B).
A-94		δ 7.49-7.16 (m, 7H), 4.38 (m, 2H), 3.91 (m, 2H), 3.30 (m, 2H), 2.18-2.08 (m, 1H), 2.14 和 2.11 (每一 s, 3H 一起), 1.75 (m, 1H), 1.55 (m, 3H), 1.37 (br. s, 3H).
A-95		δ 7.5-7.4 (m, 2H), 7.35-7.25 (m, 3H), 7.05-6.95 (2xd, 1H), 3.9 (2 x s, 3H), 1.55-1.45 (m, 12H).
A-96		δ 7.55-7.6 (d, 1H), 7.5-7.3 (m, 3H), 7.1-7.0 (dd, 2H), 3.9-3.8 (2x s, 3H), 1.6-1.5 (m, 12H).
A-97		δ 7.44 (m, 1H), 7.07 (s, 1H), 6.99 (m, 0.5H), 6.91 (m, 1H), 6.84 (m, 0.5H), 5.50 (br. d, 1H), 2.11 (s, 3H), 2.00 (s, 3H), 1.78 (s, 3H), 1.61 (d, 6H), 1.49 (d, 6H).
A-98		δ 7.58 (dd, 1H), 7.55 (s, 4H), 7.43 (d, 1H), 7.28 (s, 1H), 5.62 (br. s, 1H), 3.13 (s, 1H), 2.48 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.51 (s, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-99		m.p. 123-124 °C; LC-MS (ES ⁺) : 415, 417 (M+H) ⁺
A-100		δ 7.77 (s, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.53 (m, 3H), 7.29 (s, 1H), 6.00 (s, 1H), 2.55 (m, 2H), 1.68 (d, 6H), 1.54 (d, 6H), 1.22 (t, 3H).

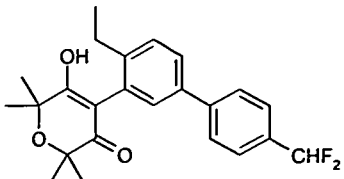
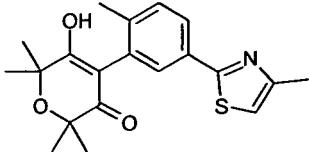
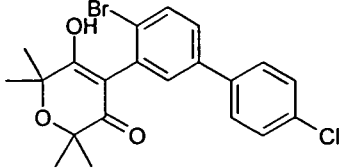
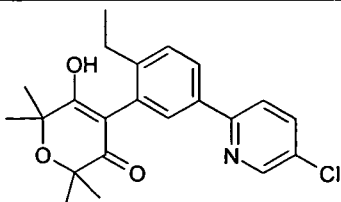
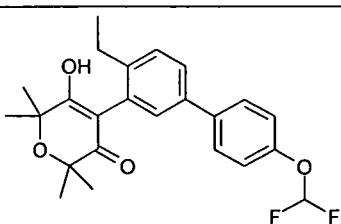
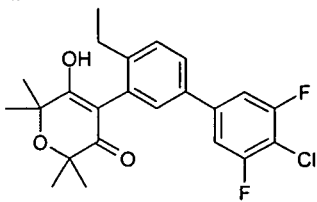
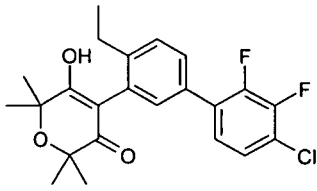
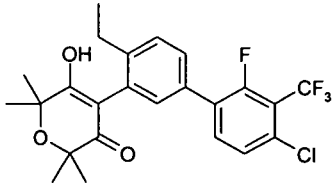
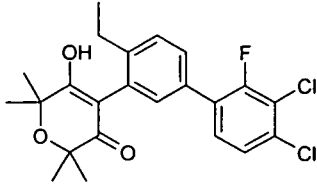
A-101		δ 7.74 (d, 2H), 7.53 (dd, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.31 (d, 2H), 7.23 (s, 1H), 5.59 (br. s, 1H), 2.47 (m, 2H), 1.61 (s, 6H), 1.49 (s, 6H), 1.15 (t, 3H).
A-102		δ 7.24-7.00 (m, 4H), 5.80 (br. s, 0.75H), 5.51 (br. s, 0.25H), 2.12 (s, 3H), 2.02 (s, 3H), 1.79 (s, 3H), 1.61 (d, 6H), 1.49 (d, 6H).
A-103		δ 7.55-7.5 (m, 1H); 7.4-7.35 (m, 1H); 7.33-7.34 (m, 1H); 7.2-7.14 (m, 2H); 7.14-6.96 (2xd, 1H); 3.86-3.75 (2xs, 3H); 1.63-1.45 (m, 12H).
A-104		DMSO-d ₆ δ 8.46 (s, 2H), 7.39 (dd, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.12 (s, 1H), 6.66 (s, 2H), 1.98 (s, 3H), 1.44 (br. s, 6H), 1.31 (br. s, 6H).
A-105		DMSO-d ₆ δ 8.19 (d, 2H), 7.71 (d, 2H), 7.60 (dd, 1H), 7.31 (s, 2H), 2.03 (s, 3H), 1.50 (br. s, 6H), 1.32 (br. s, 6H).
A-106		DMSO-d ₆ δ 8.00 (d, 1H), 7.82 (dd, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.35 (m, 2H), 2.03 (s, 3H), 1.38 (br. s, 12H).
A-107		DMSO-d ₆ δ 7.60 (s, 1H), 7.43 (dd, 1H), 7.17(m, 2H), 6.78 (d, 1H), 6.47(m, 1H), 1.95 (s, 3H), 1.40 (br. s, 12H).
A-108		DMSO-d ₆ δ 8.10 (s, 1H). 7.67 (m, 1H), 7.40 (dd, 1H), 7.19 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 6.89 (m, 1H), 1.98 (s, 3H), 1.47 (br. s, 6H), 1.33 (br. s, 6H).
A-109		DMSO-d ₆ δ 7.63 (dd, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.27 (d, 1H), 2.44 (app. d, 3H), 2.03 (s, 3H), 1.40 (br. s, 12H).

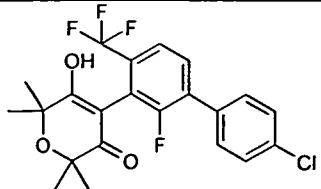
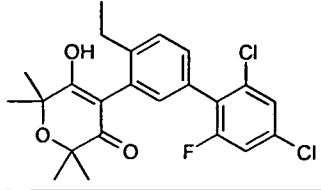
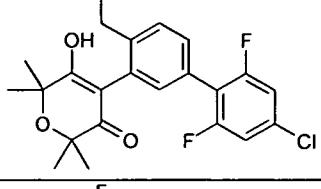
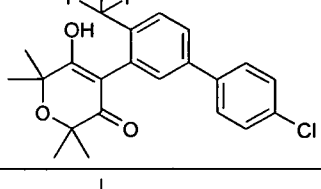
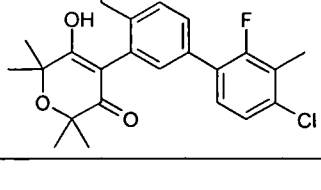
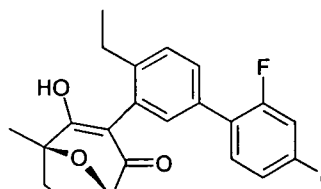
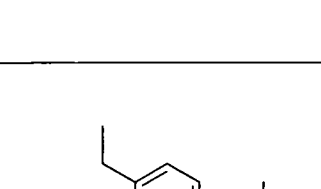
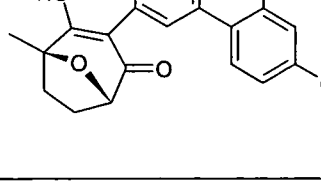
A-110		DMSO-d ₆ δ 9.09 (s, 1H), 9.04 (s, 2H), 7.60 (dd, 1H), 7.33 (m, 2H), 2.03 (s, 3H), 1.38 (br. s, 12H).
A-111		DMSO-d ₆ δ 7.70 (m, 1H), 7.50 (m, 1H), 7.42 (m, 2H), 7.17 (m, 2H), 1.94 (s, 3H), 1.35 (br. s, 12H).
A-112		DMSO-d ₆ δ 7.27 (d, 1H), 7.17 (dd, 1H), 6.89 (d, 1H), 2.35 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.04 (s, 3H), 1.40 (br. s, 12H).
A-113		DMSO-d ₆ δ 8.63 (s, 1H), 7.93 (s, 2H), 7.86 (dd, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 2.04 (s, 3H), 1.41 (br. s, 12H).
A-114		DMSO-d ₆ δ 8.65 (d, 1H), 8.28 (d, 1H), 7.56 (dd, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.23 (d, 1H), 2.06 (s, 3H), 1.41 (br. d, 12H).
A-115		DMSO-d ₆ δ 9.00 (s, 2H), 8.15 (dd, 1H), 7.91 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 2.06 (s, 3H), 1.40 (br.s, 12H).
A-116		DMSO-d ₆ δ 8.98 (s, 2H), 8.20 (dd, 1H), 7.95 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 2.11 (s, 3H), 1.45 (br. s, 12H).
A-117		DMSO-d ₆ δ 7.44 (dd, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.26 (d, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 2.03 (s, 3H), 1.45 (br. s, 12H).
A-118		DMSO-d ₆ δ 8.03 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.34 (dd, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.05 (d, 1H), 3.78 (s, 3H), 1.94 (s, 3H), 1.44 (br. s, 6H), 1.32 (br. s, 6H).
A-119		DMSO-d ₆ δ 7.42 (app. dd, 1H), 7.38 (app. d, 1H), 7.16 (d, 1H), 6.84 (s, 1H), 3.92 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.45 (br. s, 12H).

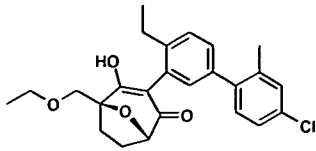
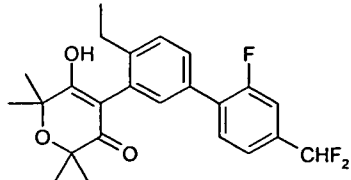
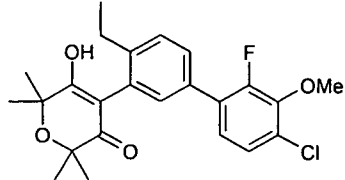
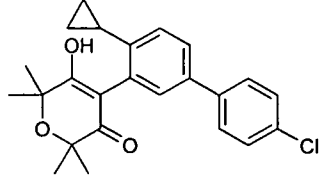
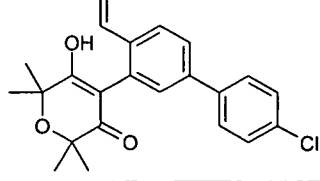
A-120		DMSO-d ₆ δ 7.62 (d, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.27 (d, 1H), 7.23 (d, 1H), 2.04 (s, 3H), 1.39 (br. s, 6H), 1.51 (br. s, 6H).
A-121		DMSO-d ₆ δ 8.20 (d, 1H), 8.08 (d, 1H), 7.98 (dd, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 2.11 (s, 3H), 1.45 (br. s, 12H).
A-122		δ 7.1-7.47 (m, 7H), 6.15 (br. s, 1H), 4.5-4.8 (m, 1H), 3.44 (s, 2H), 3.26 (s, 3H), 2.7-2.25 (m, 5H), 1.65 (s, 3H), 1.14 (m, 3H).
A-123		δ 7.64-7.12 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 5.75 (br. s, 1H, 異構物 A 和 B), 4.8 (d, 1H, 異構物 A), 4.7 (d, 1H, 異構物 B) 2.6-1.9 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 1.56 (s, 3H, 異構物 A 和 B), 1.2 (t, 3H, 異構物 A), 1.14 (t, 3H, 異構物 B).
A-124		δ 8.6 (br. s, 1H, 異構物 A), 8.4 (br. s, 1H, 異構物 B), 7.5-7.2 (m, 7H, 異構物 A 和 B), 4.9 (m, 1H, 異構物 B), 4.72 (m, 1H, 異構物 A), 4.14-3.7 (m, 4H, 異構物 A 和 B), 2.4-2.3 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 1.25 (m, 3H, 異構物 A 和 B), 1.2 (m, 3H, 異構物 B), 1.18 (m, 3H, 異構物 A).
A-125		δ 7.42-7.12 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 5.9 (br. s, 1H, 異構物 A 和 B), 4.85 (d, 1H, 異構物 A), 4.69 (d, 1H, 異構物 B), 2.5-1.95 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 1.67 (s, 3H, 異構物 A 和 B), 1.16 (t, 3H, 異構物 A), 1.11 (t, 3H, 異構物 B).
A-126		δ 8.8 (br. s, 1H, 異構物 A), 8.7 (br. s, 1H, 異構物 B), 7.51-7.15 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 4.9 (m, 1H, 異構物 B), 4.7 (m, 1H, 異構物 A), 4.2 (m, 1H, 異構物 A 和 B), 3.77-3.6 (m, 2H, 異構物 A 和 B), 3.46 (s, 1H, 異構物 A 和 B), 2.47-1.86 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 1.3 (m, 3H, 異構物 A 和 B), 1.2 (m, 3H, 異構物 B), 1.1 (m, 3H, 異構物 A).
A-127		δ 7.5-7.14 (m, 6H), 6.0 (br. s, 1H), 4.8-4.62 (m, 1H), 3.5 (s, 3H), 3.2 (m, 2H), 2.8-2.3 (m, 5H), 1.6 (s, 3H), 1.2 (t, 3H).
A-128		δ 7.47-7.25 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 6.1 (br. s, 1H, 異構物 A 和 B), 4.8 (d, 1H, 異構物 A), 4.7 (m, 1H, 異構物 B) 2.5-1.9 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 1.66 (s, 3H, 異構物 A 和 B), 1.2 (t, 3H, 異構物 A) 1.15 (t, 3H, 異構物 B).

A-129		δ 8.8 (br. s, 1H, 異構物 A), 8.6 (br. s, 1H, 異構物 B), 7.7-7.1 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 4.9 (m, 1H, 異構物 B), 4.7 (m, 1H, 異構物 A), 4.2-3.6 (m, 4H, 異構物 A 和 B), 2.7-2.3 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 1.3 (m, 3H, 異構物 A 和 B), 1.2 (t, 3H, 異構物 B), 1.1 (t, 3H, 異構物 A).
A-130		δ 7.64-7.14 (m, 6H), 5.9 (br. s, 1H), 4.6 (m, 1H), 3.48 (s, 3H), 3.3 (m, 2H), 2.8-2.4 (m, 5H), 1.7 (s, 3H), 1.15 (m, 3H).
A-131		Gum; LC-MS (ES-) 355, 353 (M-H) ⁻
A-132		Gum; LC-MS (ES-) 389, 387 (M-H) ⁻
A-133		δ 7.04-7.5 (m, 6H), 6.0 (br. s, 1H), 4.7-4.6 (m, 1H), 3.4 (m, 2H), 3.2 (m, 3H), 2.8-2.3 (m, 5H), 1.6 (s, 3H), 1.2 (m, 3H).
A-134		DMSO-d ₆ δ 8.27-8.24(2xd, 1H); 7.72-7.67 (2xd, 1H); 7.54-7.51 (2xd, 1H); 7.37-7.24 (m, 4H); 2.03 (s, 3H); 1.24-1.2 (2xs, 12H).
A-135		δ 7.59 (dd, 1H), 7.46 (m, 2H), 7.28 (s, 1H), 7.14 (m, 2H), 5.68 (s, 1H), 4.01 (s, 3H), 2.52 (m, 2H), 1.66 (s, 6H), 1.55 (d, 6H), 1.19 (t, 3H).
A-136		δ 8.12 (s, 1H), 7.72 (dd, 1H), 7.58 (m, 2H), 7.47 (d, 1H), 7.28 (s, 1H), 5.56 (s, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.62 (d, 6H), 1.51 (s, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-137		δ 7.45 (m, 3H), 7.26 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 5.82 (s, 1H), 2.54 (m, 2H), 1.66 (d, 6H), 1.53 (d, 6H), 1.21 (t, 3H).

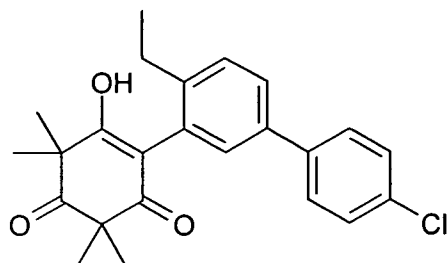
A-138		δ 7.42 (s, 2H), 7.34 (t, 1H), 7.12 (m, 2H), 5.76 (s, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.61 (d, 6H), 1.49 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).
A-139		δ 7.58 (s, 2H), 7.52 (dd, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.21 (s, 1H), 5.54 (br. s, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.62 (d, 6H), 1.50 (s, 6H), 1.14 (t, 3H).
A-140		δ 7.52 (d, 1H), 7.41-7.35 (m, 3H), 7.21 (s, 1H), 6.73 (d, 2H), 5.75 (br., 1H), 3.71 (br., 2H), 2.45 (m, 2H), 1.61 (s, 6H), 1.51 (s, 6H), 1.13 (t, 3H).
A-141		δ 7.59 (d, 1H), 7.51 (dt, 1H), 7.41-7.31 (m, 2H), 7.24-7.17 (m, 2H), 5.65 (br. s, 1H), 1.63 (d, 6H), 1.50 (d, 6H).
A-142		δ 7.60-7.56 (m, 1H), 7.56-7.51 (m, 1H), 7.50 (d, 2H), 7.41 (d, 2H), 7.38 (d, 1H), 5.59 (br. s, 1H), 1.63 (d, 6H), 1.50 (d, 6H).
A-143		δ 7.71 (s, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.38 (m, 3H), 7.32 (app. d, 2H), 7.27 (app. d, 2H), 7.17 (s, 1H), 5.31 (s, 2H), 2.17 (s, 3H), 1.65 (br. s, 6H), 1.54 (br. s, 6H).
A-144		δ 7.58 (s, 1H), 7.47 (s, 1H), 7.42 (s, 2H), 7.11 (s, 1H), 5.72 (s, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.61 (s, 6H), 1.49 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).
A-145		δ 7.90 (s, 1H), 7.55 (dd, 1H), 7.42 (m, 2H), 7.30 (dd, 1H), 7.01 (s, 1H), 3.82 (s, 3H), 2.52 (m, 2H), 1.63 (d, 6H), 1.62 (d, 6H), 1.22 (t, 3H).
A-146		δ 10.04 (s, 1H), 7.94 (app. d, 2H), 7.75 (app. d, 2H), 7.65 (dd, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.34 (d, 1H), 5.66 (br. s, 1H), 2.55-2.45 (m, 2H), 1.61-1.51 (m, 12H), 1.16 (t, 3H).

A-147		δ 7.66 (app. d, 2H), 7.61-7.56 (m, 3H), 7.45 (d, 1H), 7.29 (d, 1H), 6.69 (t, 1H), 5.69 (br. s, 1H), 2.55-2.43 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.50 (d, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-148		DMSO- d_6 δ 7.72 (dd, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.27 (s, 1H), 2.41 (s, 3H), 2.07 (s, 3H), 1.52 (br. s, 6H), 1.37 (br. s, 6H).
A-149		δ 7.76 (d, 1H), 7.51-7.37 (m, 6H), 5.55 (br. s, 1H), 1.66 (s, 3H), 1.60 (s, 3H), 1.54 (s, 3H), 1.48 (s, 3H).
A-150		甲醇- d_4 δ 8.56 (s, 1H), 7.90 (dd, 1H), 7.85 (s, 2H), 7.61 (d, 1H), 7.41 (d, 1H), 2.50 (q, 2H), 1.52 (s, 12H), 1.15 (t, 3H).
A-151		甲醇- d_4 δ 7.64 (d, 2H), 7.52 (dd, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.20 (m, 3H), 6.83 (t, 1H), 2.48 (q, 2H), 1.51 (s, 12H), 1.13 (t, 3H).
A-152		δ 7.58 (dd, 1H), 7.49 (d, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.26 (s, 1H), 7.24 (s, 1H), 5.64 (br. s, 1H), 2.59-2.47 (m, 2H), 1.67 (app. d, 6H), 1.55 (s, 6H), 1.20 (t, 3H).
A-153		δ 7.58-7.46 (m, 2H), 7.31-7.19 (m, 3H), 7.57 (br. s, 1H), 2.60-2.45 (m, 2H), 1.66 (s, 6H), 1.55-1.53 (m, 6H), 1.23-1.18 (m, 3H).
A-154		δ 7.55-7.44 (m, 3H), 7.36 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 5.70 (br. s, 1H), 2.55-2.44 (m, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.49 (app. d, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-155		δ 7.51 (dt, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.34-7.27 (m, 2H), 7.21 (t, 1H), 5.74 (br. s, 1H), 2.55-2.44 (m, 2H), 1.61 (s, 6H), 1.49 (app. d, 6H), 1.16 (t, 3H).

A-156		甲醇- d_4 δ 7.65 (app. d, 2H), 7.59 (app. d, 1H), 7.56 (app. d, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.47 (s, 1H), 1.50 (s, 6H), 1.47 (s, 6H).
A-157		δ 7.50 (d, 1H), 7.40-7.37 (m, 2H), 7.18-7.15 (dd, 1H), 7.11 (s, 1H), 5.82 (br. s, 1H), 2.63-2.47 (m, 2H), 1.65 (app. d, 6H), 1.54 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.22 (t, 3H).
A-158		δ 7.49 (s, 2H), 7.20 (br. s, 1H), 7.09-7.05 (m, 2H), 5.78 (br. s, 1H), 2.60-2.48 (m, 2H), 1.65 (s, 3H), 1.62 (s, 3H), 1.54 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.21 (t, 3H).
A-159		δ 7.83 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.54 (d, 2H), 7.44 (d, 2H), 7.39 (s, 1H), 5.48 (br. s, 1H), 1.60 (app. d, 6H), 1.47 (s, 6H).
A-160		δ 7.55 (d, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.27-7.22 (m, 3H), 5.74 (br. s, 1H), 2.58-2.47 (m, 2H), 2.41 (d, 3H), 1.66 (s, 6H), 1.54 (app. d, 6H), 1.20 (t, 3H).
A-161		δ 7.5-6.9 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 6.1 (d, 1H, 異構物 A), 5.95 (d, 1H, 異構物 B), 4.8 (t, 1H, 異構物 A), 4.7 (t, 1H, 異構物 B), 2.6-2.3 (m, 3H, 異構物 A 和 B), 2.1-1.8 (m, 3H, 異構物 A 和 B), 1.6 (s, 3H, 異構物 A 和 B), 0.9-0.8 (m, 3H, 異構物 A 和 B).
A-162		δ 7.40-6.88 (m, 6H each of 異構物 I 和 II), 5.9 (d, 1H, 異構物 II), 5.8 (s, 1H, 異構物 I), 4.85 (t, 1H, 異構物 I), 4.7 (m, 1H, 異構物 II), 2.6-1.8 (m, 9H each of 異構物 I 和 II), 1.5 (s, 3H 每一異構物 I 和 II), 1.2 (t, 3H, 異構物 II), 1.1 (t, 3H, 異構物 I).
A-163		δ 8.47 (s, 1H, 異構物 A), 8.22 (s, 1H, 異構物 B), 7.5-7.0 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 4.9 (d, 1H, 異構物 B), 4.7 (t, 1H, 異構物 A), 4.2-3.5 (m, 4H, 異構物 A 和 B), 2.6-1.9 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 1.3-1.1 (m, 6H, 異構物 A 和 B).

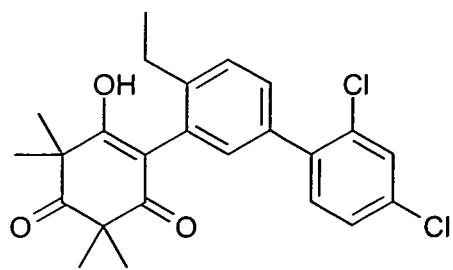
		構物 A 和 B)
A-164		δ 8.08 (s, 1H, 異構物 A), 8.07 (s, 1H, 異構物 B), 7.5-6.9 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 4.9 (m, 1H, 異構物 B), 4.7 (m, 1H, 異構物 A), 4.6 (s, 1H, 異構物 A 和 B), 4.2-3.5 (m, 3H, 異構物 A 和 B), 2.76 (s, 3H, 異構物 A 和 B), 2.6-1.9 (m, 6H, 異構物 A 和 B), 1.3-1.1 (m, 6H, 異構物 A 和 B).
A-165		δ 7.62-7.57 (m, 2H), 7.50 (d, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.29 (s, 1H), 6.71 (t, 1H), 5.76 (br. s, 1H), 2.60-2.49 (m, 2H), 1.66 (s, 6H), 1.54 (app. d, 6H), 1.21 (t, 3H).
A-166		δ 7.52 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.21-7.19 (m, 2H), 7.10 (t, 1H), 5.69 (br. s, 1H), 3.99 (s, 3H), 2.54-2.43 (m, 2H), 1.61 (s, 6H), 1.50 (app. d, 6H), 1.16 (t, 3H).
A-167		δ 7.58-7.51 (m, 3H), 7.47-7.42 (m, 2H), 7.31 (m, 1H), 7.18 (d, 1H), 5.71 (br. s, 1H), 1.82-1.75 (m, 1H), 1.67 (s, 6H), 1.56 (app. d, 6H), 0.94-0.88 (m, 2H), 0.85-0.79 (m, 1H), 0.63-0.58 (m, 1H).
A-168		δ 7.80 (d, 1H), 7.64 (dd, 1H), 7.57 (app. d, 2H), 7.45 (app. d, 2H), 7.34 (d, 1H), 6.67 (dd, 1H), 5.82 (d, 1H), 5.69 (br. s, 1H), 5.36 (d, 1H), 1.66 (app. d, 6H), 1.55 (s, 6H).

實施例 23：6-(4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,4,4-四甲基環己烷-1,3,5-三酮之製備

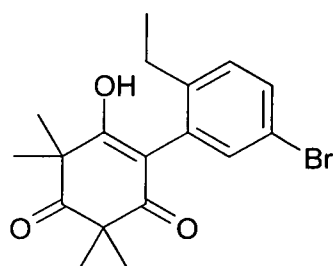


將無水氯仿（3.60 毫升）加入 2,2,4,4-四甲基環己烷-1,3,5-三酮（0.100 公克，0.55 毫莫耳）與 N,N-二甲胺基吡啶（0.33 公克，2.70 毫莫耳）之混合物中，接著在室溫下攪拌，直到溶解為止。接著將無水甲苯（1.00 毫升）加入該溶液中，接著加入一份三乙酸 4'-氯基-4-乙基聯苯-3-鉛（0.36 公克，0.60 毫莫耳）。將溶液在 80°C 下加熱 1 小時，接著冷卻至室溫下，接著加入二氯甲烷（200 毫升），接著以 1M 水性氫氯酸（200 毫升）清洗。將有機相分開，經無水硫酸鎂乾燥，過濾及將過濾物在真空中濃縮。將殘餘物在矽膠上以快速管柱層析法（5：1 之比的己烷 / 乙酸乙酯）純化，以供應成為白色結晶固體的 6-(4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,4,4-四甲基環己烷-1,3,5-三酮（0.17 公克）。

實施例 24：6-(2',4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,4,4-四甲基環己烷-1,3,5-三酮之製備



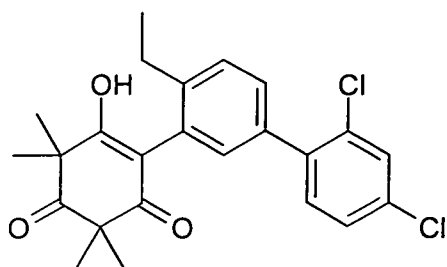
步驟 1：6-(5-溴基-2-乙苯基)-2,2,4,4-四甲基環己烷-1,3,5-三酮之製備



將無水氯仿（25 毫升）及甲苯（6.3 毫升）加入 2,2,4,4-四甲基環己烷-1,3,5-三酮（0.6 公克，3.6 毫莫耳）、三乙酸 5-溴基-2-乙基苯鉛（2.27 公克，4.00 毫莫耳）與 N,N-二甲胺基吡啶（2.22 公克，18 毫莫耳）之混合物中，並將反應混合物在 80℃ 下加熱 3 小時。將混合物以二氯甲烷（50 毫升）及 2M 水性氫氯酸（100 毫升）稀釋，並由矽藻土過濾，以移除無機殘餘物。將濾餅以二氯甲烷清洗，並將所有的有機部分合併，以鹽水清洗，經無水硫酸鎂乾燥及接著過濾。將過濾物在真空中濃縮及將殘餘物以快速管柱層析法純化，得到成為白色固體的 6-(5-溴基-2-乙苯基)-2,2,4,4-四甲基環己烷-1,3,5-三酮（0.84 公克）。

步驟 2：6-(2',4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,4,4-四甲基

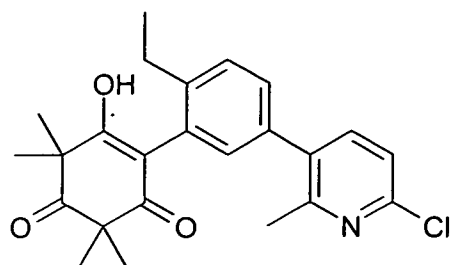
環己烷-1,3,5-三酮之製備



將乙酸鈹(II) (1.1 毫克, 0.0049 毫莫耳)、參(磺苯基)磷三鈉鹽 (5.1 毫克, 0.0099 毫莫耳)、2,4-二氯苯基硼酸 (0.099 公克, 0.5 毫莫耳)、6-(5-溴基-2-乙苯基)-2,2,4,4-四甲基環己烷-1,3,5-三酮 (0.19 公克, 0.5 毫莫耳) 及磷酸鉀 (0.53 公克, 2.5 毫莫耳) 加入微波小瓶中。接著加入脫氣之水 (0.75 毫升) (從小瓶載片洗掉任何固體), 接著攪拌 5 分鐘及以氫氣沖洗。接著將該混合物在微波照射下於 160°C 下加熱 15 分鐘。加入更多量的 2,4-二氯苯基硼酸 (0.099 公克, 0.5 毫莫耳) 及磷酸鉀 (0.095 公克, 0.5 毫莫耳), 將反應混合物再覆蓋在氫大氣下及將混合物在 160°C 下再加熱 15 分鐘。在冷卻至室溫之後, 將反應混合物以二氯甲烷 (5 毫升) 稀釋及以 2M 水性氫氯酸酸化。將有機相分開, 經無水硫酸鎂乾燥及經由矽膠塞過濾。將過濾物在減壓下濃縮及將殘餘物溶解在 N,N-二甲基甲醯胺 (約 1 毫升) 中, 並以製備性反相 HPLC 純化, 以供應成為無色油的 6-(2',4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,4,4-四甲基環己烷-1,3,5-三酮 (80.6 毫克)。

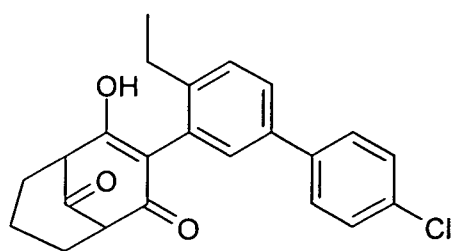
實施例 25: 6-[5-(6-氯基-2-甲基吡啶-3-基)-2-乙苯基]-

2,2,4,4-四甲基環己烷-1,3,5-三酮之製備



將 6-(5-溴基-2-乙苯基)-2,2,4,4-四甲基環己烷-1,3,5-三酮 (0.19 公克, 0.5 毫莫耳)、氟化鉍 (0.24 公克, 1.6 毫莫耳)、6-氯基-2-甲基吡啶-3-基硼酸 (0.13 公克, 0.8 毫莫耳) 與脫氣之 1,2-二甲氧基乙烷 (1.7 毫升) 之混合物在氮氣下於室溫下攪拌 30 分鐘。加入 [1,1'-雙(二苯膦基)二茂鐵]二氯基鈮(II) (0.034 公克, 0.042 毫莫耳), 並將混合物在室溫下攪拌 10 分鐘及接著在 80°C 下加熱隔夜。在冷卻至室溫之後, 將反應混合物以二氯甲烷 (5 毫升) 及水稀釋, 並經由矽藻土過濾。將過濾物以 2M 水性氫氯酸酸化, 並將有機相分開, 經無水硫酸鎂乾燥及在真空中濃縮。將殘餘物溶解在 N,N-二甲基甲醯胺 (約 1 毫升) 中及以製備性反相 HPLC 純化, 以供應成為淡棕色固體的 6-[5-(6-氯基-2-甲基吡啶-3-基)-2-乙苯基]-2,2,4,4-四甲基環己烷-1,3,5-三酮 (75.3 毫克)。

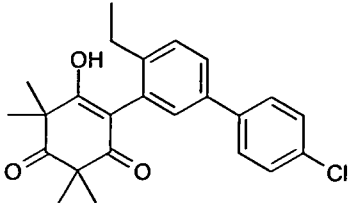
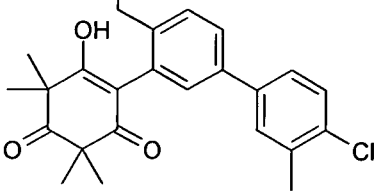
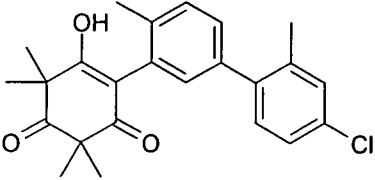
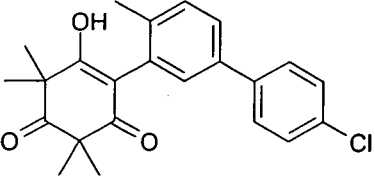
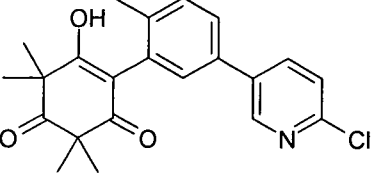
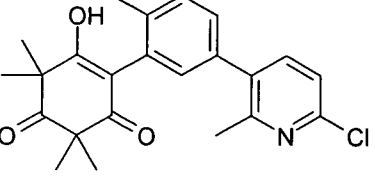
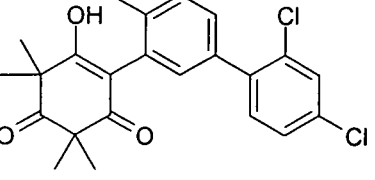
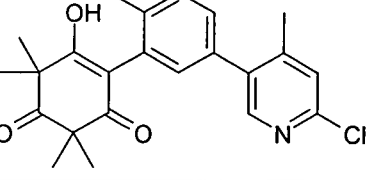
實施例 26: 3-(4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)雙環[3.2.1]壬烷-2,4,9-三酮之製備

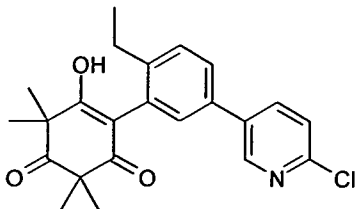
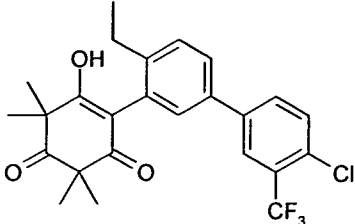
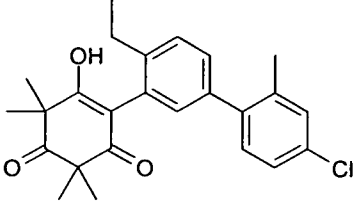
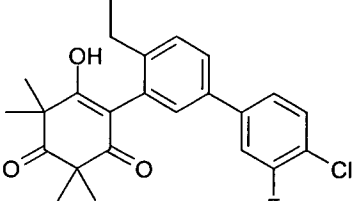
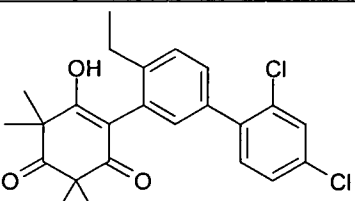
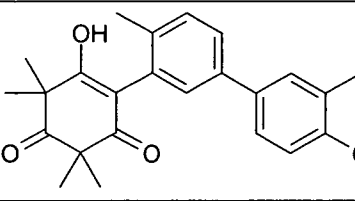
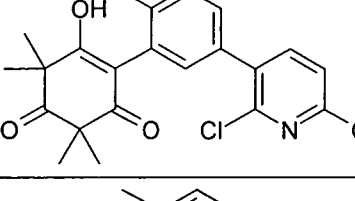
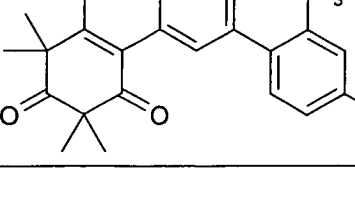


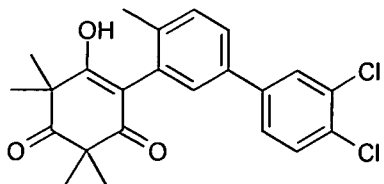
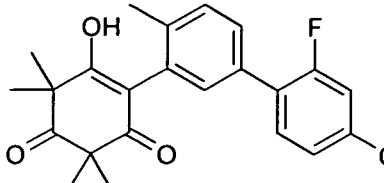
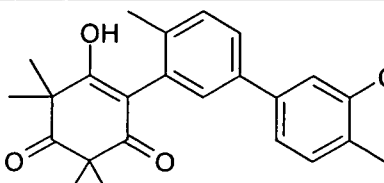
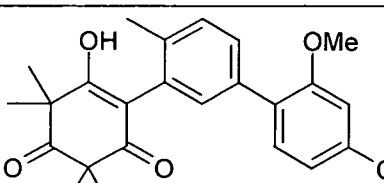
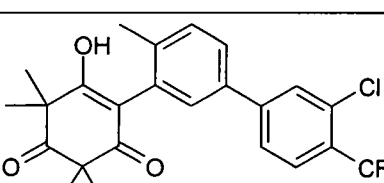
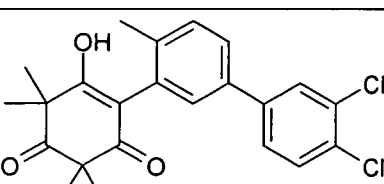
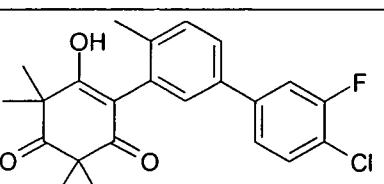
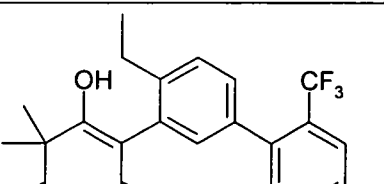
將三乙基 4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基 (0.94 公克, 1.57 毫莫耳) 小心地加入在 80°C 下在無水氯仿 (10 毫升) 與甲苯 (2.5 毫升) 之混合物中的雙環[3.2.1]壬烷-2,4,9-三酮 (根據 F. Effenberger 等人於 Chem Ber. (1985) 119, 3394-3404 之步驟所製備) (0.237 公克, 1.42 毫莫耳) 及 N,N-二甲胺基吡啶 (0.87 公克, 7.13 毫莫耳) 之溶液中。將混合物在 80°C 下攪拌 3 小時, 接著冷卻至室溫, 以二氯甲烷稀釋及加入 2M 水性氫氯酸。將混合物經由矽藻土過濾, 以移除無機殘餘物。將濾餅以二氯甲烷清洗, 並將過濾物合併, 以鹽水清洗, 經無水硫酸鎂乾燥及過濾。將過濾物在真空中濃縮及將殘餘物在矽膠上以快速管柱層析法純化, 並接著以製備性反相 HPLC 進一步純化, 得到成為灰白色固體的 3-(4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)雙環[3.2.1]壬烷-2,4,9-三酮 (0.087 公克)。

在表 B 中的額外化合物係以類似的步驟從適當的原料所製備。

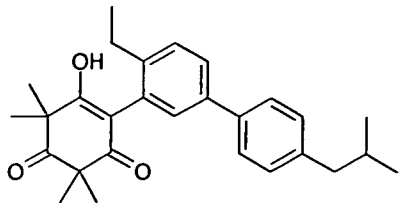
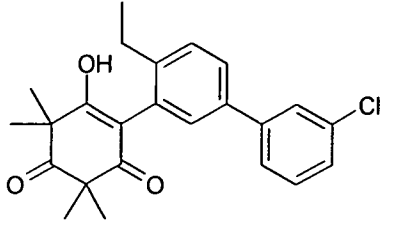
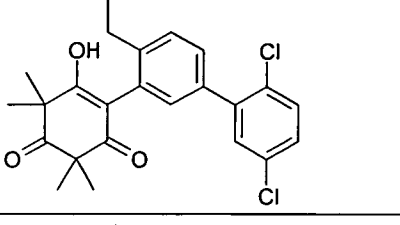
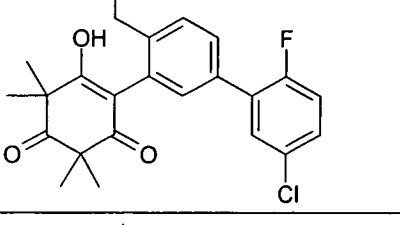
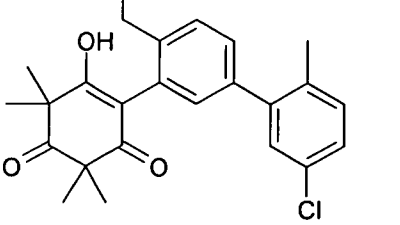
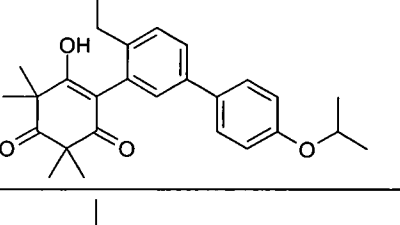
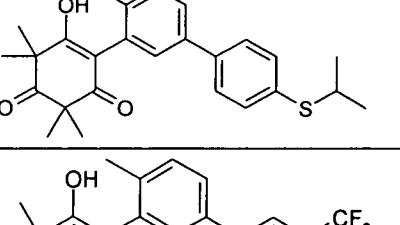
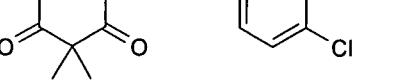
表 B

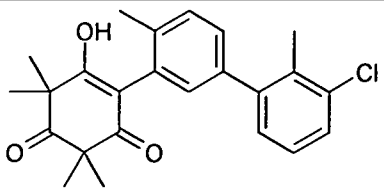
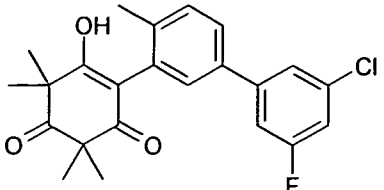
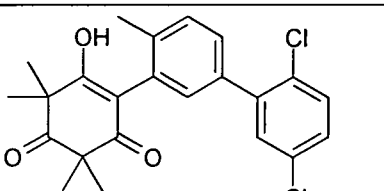
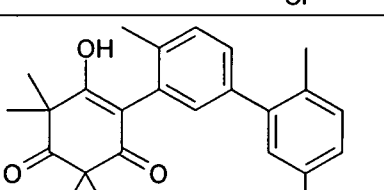
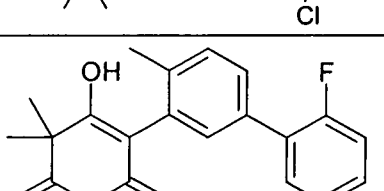
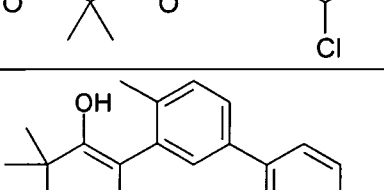
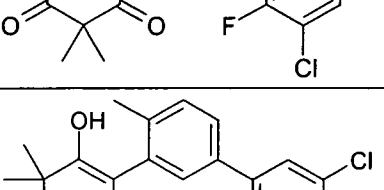
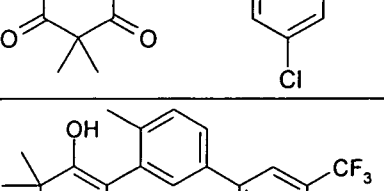
化合物編號	結構	^1H nmr (CDCl_3 , 除非有另外陳述) 或其他的物理數據
B-1		δ 7.58 (dd, 1H), 7.52-7.59 (m, 2H), 7.45 (d, 1H), 7.41-7.38 (m, 2H), 7.25 (d, 1H), 5.74 (s, 1H), 2.54-2.43 (m, 2H), 1.56 (app. d, 6H), 1.46 (app. d, 6H), 1.15 (t, 3H).
B-2		δ 7.55 (dd, 1H), 7.44-7.29 (m, 4H), 7.22-7.26 (m, 1H), 5.91 (br. s, 1H), 2.52-2.39 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 1.55 (app. d, 6H), 1.45 (app. d, 6H), 1.14 (t, 3H).
B-3		δ 7.38 (m, 1H), 7.25 (m, 2H), 7.18 (m, 2H), 7.02 (s, 1H), 5.84 (b, 1H), 2.28 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.56 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.48 (s, 3H), 1.42 (s, 3H).
B-4		δ 7.55 (m, 3H), 7.43 (m, 3H), 7.3 (m, 1H), 5.9 (s, 1H), 2.23 (s, 3H), 1.61 (d, 6H), 1.5 (d, 6H).
B-5		δ 8.37 (s, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.8 (m, 1H), 7.34 (m, 2H), 7.12 (m, 1H), 1.82 (b, 6H), 1.5 (b, 6H).
B-6		δ 7.5 (d, 1H), 7.4 (d, 1H), 7.28 (dd, 1H), 7.2 (d, 1H), 7.04 (d, 1H), 2.5 (s, 3H), 2.2 (s, 3H), 1.56 (bd, 6H), 1.43 (bd, 6H).
B-7		δ 7.5 (s, 1H), 7.4 (s, 2H), 7.3 (m, 2H), 7.17 (s, 1H), 2.21 (s, 3H), 1.55 (b, 6H), 1.48 (s, 3H), 1.42 (s, 3H).
B-8		δ 7.9 (s, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.21 (s, 1H), 7.14 (d, 1H), 7.04 (s, 1H), 2.31 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 1.55 (d, 6H), 1.45 (d, 6H).

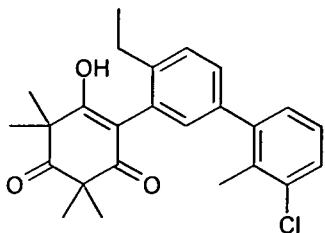
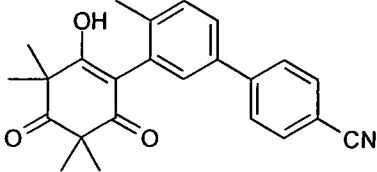
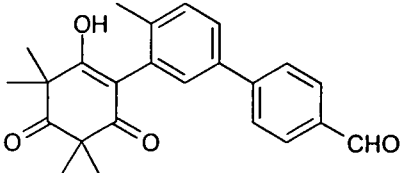
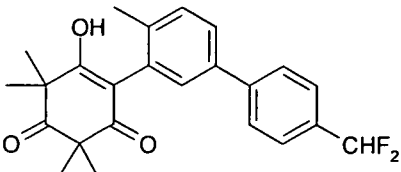
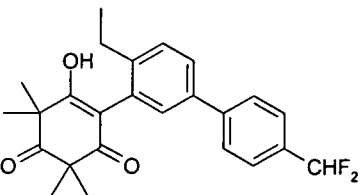
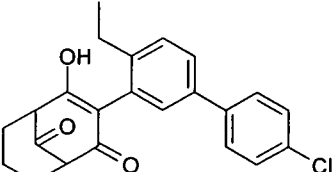
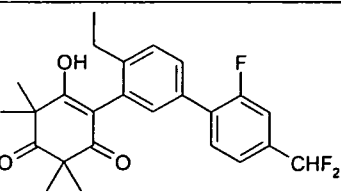
化合物編號	結構	¹ H nmr (CDCl ₃ , 除非有另外陳述) 或其他的物理數據
B-9		δ 8.32 (d, 1H), 7.52-7.38 (m, 1H), 7.83 (dd, 1H), 7.34 (d, 1H), 7.29-7.21 (m, 2H), 6.03-5.67 (m, 1H), 2.58-2.35 (m, 2H), 1.65-1.38 (m, 12H), 1.16 (t, 2.3H), 1.10 (t, 0.7H).
B-10		δ 7.87 (d, 1H), 7.67 (dd, 1H), 7.61-7.53 (m, 2H), 7.51-7.46 (m, 1H), 7.31-7.23 (m, 1H), 5.73 (s, 1H), 2.50 (m, 2H), 1.62-1.52 (m, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.16 (t, 3H).
B-11		δ 7.42 (d, 1H), 7.32 (dd, 1H), 7.29-7.24 (m, 1H), 7.23-7.14 (m, 2H), 7.03-6.99 (m, 1H), 5.84 (br. s, 1H), 2.50 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 1.55 (d, 6H), 1.44 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).
B-12		δ 7.57 (dd, 1H), 7.48-7.41 (m, 2H), 7.38-7.28 (m, 2H), 7.25-7.23 (m, 1H), 5.85 (s, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.16 (t, 3H).
B-13		δ 7.49 (s, 1H), 7.44 (s, 2H), 7.34-7.29 (m, 2H), 7.14 (s, 1H), 6.02-5.91 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 1.55 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).
B-14		δ 7.51 (m, 1H), 7.4 (m, 1H), 7.31 (m, 1H), 7.29 (s, 1H), 5.87 (s, 1H), 2.42 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.57 (s, 6H), 1.46 (d, 6H).
B-15		δ 7.68 (d, 1H), 7.41 (m, 2H), 7.34 (d, 1H), 7.18 (d, 1H), 6.1 (b, 1H), 2.21 (s, 3H) 1.4-1.55 (br, 12H).
B-16		δ 7.72 (d, 1H), 7.53 (dd, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.28 (m, 1H), 7.05 (s, 1H), 5.9 (s, 1H), 2.21 (s, 3H), 1.56 s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.47 (s, 3H), 1.4 (s, 3H).

化合物編號	結構	¹ H nmr (CDCl ₃ , 除非有另外陳述) 或其他的物理數據
B-17		δ 7.69 (s, 1H), 7.51 (m, 2H), 7.42 (m, 2H), 7.3 (s, 1H), 5.89 (s, 1H), 2.25 (s, 3H), 1.6 (br, 6H), 1.51 (br, 6H).
B-18		δ 7.53 (m, 1H), 7.45 (m, 2H), 7.28 (m, 3H), 6.0 (s, 1H), 2.24 (s, 3H), 1.6 (d, 6H), 1.5 (d, 6H).
B-19		δ 7.52 (m, 2H), 7.37 (m, 2H), 7.28 (m, 2H), 5.87 (s, 1H), 2.4 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (d, 6H).
B-20		δ 7.48 (m, 1H), 7.4 (m, 1H), 7.29 (m, 1H), 7.22 (s, 1H), 7.03 (d, 1H), 6.99 (s, 1H), 6.29 (s, 1H), 3.86 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 1.61 (d, 6H), 1.51 (s, 3H), 1.48 (s, 3H).
B-21		δ 7.77 (m, 2H), 7.59 (m, 2H), 7.49 (s, 1H), 7.34 (s, 1H), 5.88 (b, 1H), 2.26 (s, 3H), 1.62 (d, 6H), 1.5 (d, 6H).
B-22		δ 7.85 (s, 1H), 7.71 (dd, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.5 (dd, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.26 (s, 1H), 5.8 (b, 1H), 2.2 (s, 3H), 1.55 (d, 6H), 1.46 (d, 6H).
B-23		δ 7.51 (d, 1H), 7.42 (m, 2H), 7.35 (dd, 1H), 7.3 (m, 2H), 5.83 (s, 1H), 2.19 (s, 3H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (s, 6H).
B-24		δ 7.73-7.71 (m, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.36-7.30 (m, 2H), 7.03 (s, 1H), 5.80 (br. s, 1H), 2.56-2.44 (m, 2H), 1.54 (d, 6H), 1.44 (d, 6H), 1.18 (t, 3H).

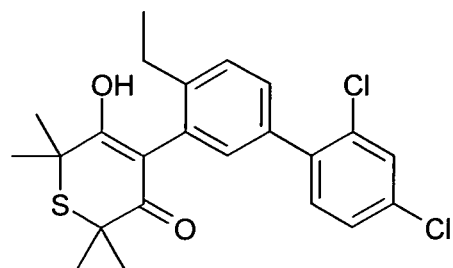
化合物編號	結構	¹ H nmr (CDCl ₃ , 除非有另外陳述) 或其他的物理數據
B-25		δ 7.50 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.27-7.23 (m, 1H), 7.15-7.18 (m, 1H), 7.02-6.98 (m, 1H), 6.96-6.93 (m, 1H), 6.16-6.04 (m, 1H), 3.81 (s, 3H), 2.54-2.41 (m, 2H), 1.55 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.15 (t, 3H).
B-26		δ 7.47 (d, 1H), 7.45-7.39 (m, 2H), 7.30-7.21 (m, 1H), 6.99-6.95 (m, 1H), 6.01-5.76 (m, 1H), 2.58-2.43 (m, 2H), 1.52-1.60 (m, 6H), 1.44 (d, 6H), 1.19 (t, 3H).
B-27		δ 7.86-7.84 (m, 1H), 7.74 (dd, 1H), 7.58-7.53 (m, 2H), 7.50-7.47 (m, 1H), 7.29-7.23 (m, 1H), 5.92 (br. s, 1H), 2.57-2.44 (m, 2H), 1.60-1.55 (m, 6H), 1.47 (d, 6H), 1.16 (t, 3H).
B-28		δ 8.10-7.94 (m, 1H), 7.50-7.35 (m, 1H), 7.29-7.20 (m, 2H), 7.03-7.00 (m, 1H), 6.58-6.31 (m, 1H), 2.59-2.48 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.56 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).
B-29		δ 7.68 (d, 1H), 7.50-7.44 (m, 2H), 7.34 (d, 1H), 7.19-7.15 (m, 1H), 6.01-5.95 (m, 1H), 2.57-2.45 (m, 2H), 1.56 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.18 (t, 3H).
B-30		δ 7.51 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.34 (dd, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.04-7.00 (m, 1H), 6.04-5.82 (m, 1H), 2.58-2.44 (m, 2H), 2.52 (s, 3H), 1.56 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.18 (t, 3H).
B-31		δ 7.54 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.38 (t, 1H), 7.23-7.16 (m, 3H), 5.96-5.84 (m, 1H), 2.56-2.42 (m, 2H), 1.56 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.16 (t, 3H).

化合物編號	結構	¹ H nmr (CDCl ₃ , 除非有另外陳述) 或其他的物理數據
B-32		δ 7.62-7.58 (m, 1H), 7.48 (d, 2H), 7.42 (d, 1H), 7.29-7.25 (m, 1H), 7.20 (d, 2H), 6.03-5.96 (m, 1H), 2.54-2.41 (m, 2H), 2.51 (d, 2H), 1.94-1.83 (m, 1H), 1.56 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.15 (t, 3H), 0.93 (d, 6H).
B-33		δ 7.61-7.54 (m, 2H), 7.45 (d, 2H), 7.38-7.29 (m, 2H), 7.27-7.25 (m, 1H), 5.91-5.84 (m, 1H), 2.55-2.42 (m, 2H), 1.59-1.54 (m, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.16 (t, 3H).
B-34		δ 7.47-7.44 (m, 2H), 7.41-7.36 (m, 2H), 7.26-7.23 (m, 1H), 7.15 (s, 1H), 6.00-5.94 (m, 1H), 2.57-2.44 (m, 2H), 1.55 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).
B-35		δ 7.56 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.43 (dd, 1H), 7.29-7.21 (m, 2H), 7.08 (t, 1H), 5.99-5.90 (m, 1H), 2.56-2.41 (m, 2H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.16 (t, 3H).
B-36		δ 7.42 (d, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.25-7.16 (m, 3H), 7.03-7.00 (m, 1H), 5.87 (s, 1H), 2.57-2.42 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 1.55 (d, 6H), 1.45 (d, 6H), 1.17 (t, 3H).
B-37		δ 7.54-7.58 (m, 1H), 7.48 (d, 2H), 7.40 (d, 1H), 7.24-7.22 (m, 1H), 6.94 (d, 2H), 6.03-5.95 (m, 1H), 4.58 (quintet, 1H), 2.52-2.39 (m, 2H), 1.56 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.36 (d, 6H), 1.15 (t, 3H).
B-38		δ 7.61-7.58 (m, 1H), 7.51 (d, 2H), 7.46-7.42 (m, 3H), 7.28-7.26 (m, 1H), 5.87 (br. s, 1H), 3.41 (quintet, 1H), 2.54-2.41 (m, 2H), 1.56 (d, 6H), 1.46 (d, 6H), 1.32 (d, 6H), 1.15 (t, 3H).
B-39		δ 7.91 (s, 1H), 7.71 (dd, 1H), 7.6 (m, 2H), 7.49 (d, 1H), 7.32 (s, 1H), 5.89 (s, 1H), 2.26 (s, 3H), 1.59 (d, 6H), 1.56 (d, 6H).

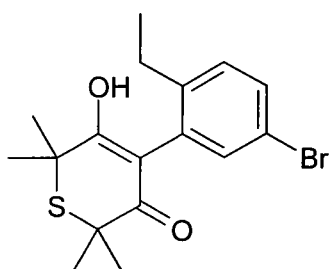
化合物編號	結構	¹ H nmr (CDCl ₃ , 除非有另外陳述) 或其他的物理數據
B-40		δ 7.38 (m, 2H), 7.27 (d, 1H), 7.13 (m, 2H), 7.02 (s, 1H), 5.84 (s, 1H), 2.3 (s, 3H), 2.2 (s, 3H), 1.56 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.47 (s, 3H), 1.42 (s, 3H).
B-41		δ 7.5 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.25 (d, 1H), 7.17 (m, 1H), 7.06 (m, 1H), 5.78 (s, 1H), 2.2 (s, 3H), 1.56 (d, 6H), 1.47 (d, 6H).
B-42		δ 7.4 (m, 4H), 7.24 (m, 1H), 7.17 (s, 1H), 6.0 (s, 1H), 2.21 (s, 3H), 1.54 (d, 6H), 1.45 (d, 6H).
B-43		δ 7.38 (d, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.2 (m, 3H), 7.02 (s, 1H), 5.84 (s, 1H), 2.23 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.54 (d, 6H), 1.46 (s, 3H), 1.43 (s, 3H).
B-44		δ 7.5 (m, 1H), 7.41 (d, 2H), 7.27 (m, 2H), 7.08 (t, 1H), 5.9 (s, 1H), 2.2 (s, 3H), 1.54 (s, 6H), 1.46 (s, 3H), 1.43 (s, 3H).
B-45		δ 7.49 (d, 1H), 7.41 (m, 1H), 7.37 (m, 1H), 7.32 (m, 1H), 7.28 (s, 1H), 7.13 (m, 1H), 5.94 (s, 1H), 2.21 (s, 3H), 1.54 (s, 6H), 1.47 (s, 3H), 1.42 (s, 3H).
B-46		δ 7.51 (d, 1H), 7.42 (m, 3H), 7.32 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 5.8 (s, 1H), 2.2 (s, 3H), 1.56 (s, 6H), 1.47 (d, 6H).
B-47		δ 7.99 (s, 2H), 7.85 (s, 1H), 7.59 (m, 1H), 7.49 (m, 1H), 7.31 (s, 1H), 2.2 (s, 3H), 1.55 (b, 6H), 1.48 (b, 6H).

化合物編號	結構	¹ H nmr (CDCl ₃ , 除非有另外陳述) 或其他的物理數據
B-48		δ 7.42 (d, 1H), 7.38-7.34 (m, 1H), 7.32 (dd, 1H), 7.16 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.01 (d, 1H), 5.86 (br. s, 1H), 2.57-2.43 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 1.55 (d, 6H), 1.44 (d, 6H), 1.18 (t, 3H).
B-49		δ 7.69 (q, 4H), 7.57 (dd, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.31 (s, 1H), 5.81 (s, 1H), 2.21 (s, 3H), 1.57 (s, 6H), 1.46 (s, 6H).
B-50		δ 10.04 (s, 1H), 7.93 (d, 2H), 7.73 (d, 2H), 7.61 (dd, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.37 (s, 1H), 5.88 (b, 1H), 2.21 (s, 3H), 1.56 (d, 6H), 1.47 (d, 6H).
B-51		δ 7.65 (m, 2H), 7.58 (m, 3H), 7.43 (d, 1H), 7.31 (s, 1H), 6.82 – 6.54 (t, 1H), 5.84 (s, 1H), 2.2 (s, 3H), 1.57 (d, 6H), 1.46 (d, 6H)
B-52		δ 7.66 (app. d, 2H), 7.62 (dd, 1H), 7.57 (app. d, 2H), 7.47 (d, 1H), 7.30 (d, 1H), 6.69 (t, 1H), 5.80 (br. s, 1H), 2.55-2.44 (m, 2H), 1.57 (br. s, 6H), 1.47 (app. d, 6H), 1.16 (t, 3H)
B-53		m.p. 79.5 °C; LC-MS (ES+) 381 (M+H) ⁺
B-54		δ 7.65-7.50 (m, 3H), 7.40-7.29 (m, 3H), 6.71 (t, 1H), 5.93 (br. s, 1H), 2.61-2.48 (m, 2H), 1.61-1.60 (m, 6H), 1.51-1.47 (m, 6H), 1.23-1.18 (m, 3H).

實施例 27：4-(2',4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基硫代吡喃-3,5-二酮之製備



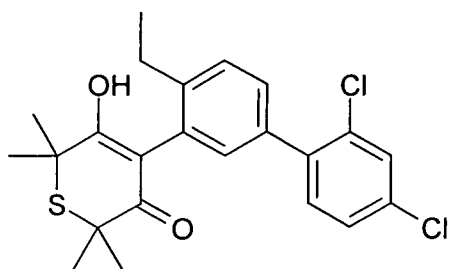
步驟 1：4-(5-溴基-2-乙苯基)-2,2,6,6-四甲基硫代吡喃-3,5-二酮之製備



將甲苯（18 毫升）加入在氯仿（60 毫升）中的 2,2,6,6-四甲基硫代吡喃-3,5-二酮（根據 E. Er 和 P. Margaretha 於 Helvetica Chimica Acta (1992), 75 (7), 2265-69 之步驟所製備）（1.8 公克，9.9 毫莫耳）及 N,N-二甲胺基吡啶（5.3 公克，4.34 毫莫耳）之溶液，接著加入一份三乙酸 5-溴基-2-乙基苯鉛（6.2 公克，1.09 毫莫耳）。將所得混合物在回流下加熱 2 小時，接著允許冷卻至周圍溫度，以二氯甲烷及 1M 水性氫氯酸稀釋，並將有機相分開。將有機相在減壓下濃縮，並將殘餘物在矽膠上以快速層析法（95：5

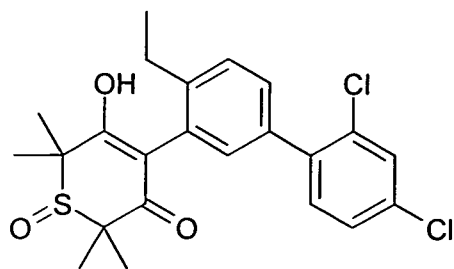
至 7 : 3 之比的己烷 / 乙酸乙酯) 純化, 得到成為橘色固體的 4-(5-溴基-2-乙苯基)-2,2,6,6-四甲基硫代吡喃-3,5-二酮 (2.42 公克)。

步驟 2 : 4-(2',4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基硫代吡喃-3,5-二酮之製備



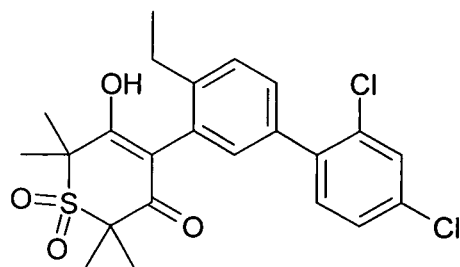
將 4-(5-溴基-2-乙苯基)-2,2,6,6-四甲基硫代吡喃-3,5-二酮 (500 毫克, 1.36 毫莫耳)、2,4-二氯苯基硼酸 (389 毫克, 2.05 毫莫耳)、氯化[1,1-雙(二苯膦基)二茂鐵]鈀(II) (111 毫克, 0.000136 莫耳) 及氟化鈾 (620 毫克, 0.00408 莫耳) 在氮大氣下加入微波小瓶中, 接著加入脫氣之 1,2-二甲氧基乙烷 (3 毫升)。接著將混合物在周圍溫度下攪拌 5 分鐘, 接著在微波照射下於 160°C 下加熱 15 分鐘。將反應混合物冷卻至室溫, 並分溶在 2M 水性氫氟酸與二氯甲烷之間。將有機相分開及在減壓下濃縮。將殘餘物以製備性反相 HPLC 純化, 得到成為棕色膠的 4-(2',4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基硫代吡喃-3,5-二酮 (264 毫克)。

實施例 28 : 4-(2',4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基-1-酮基硫代吡喃-3,5-二酮之製備



將 4-(2',4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基硫代吡喃-3,5-二酮 (79 毫克, 0.1816 毫莫耳)、過乙酸 (1.8 公克, 7.2 毫莫耳, 在乙酸中的 36-40% 溶液) 與二氯甲烷 (0.23 毫升) 之混合物在周圍溫度下攪拌 4 小時。將反應混合物分溶在水與二氯甲烷之間, 並將有機相分開, 接著在減壓下濃縮。將殘餘物以製備性反相 HPLC 純化, 得到成為澄清膠的 4-(2',4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基-1-酮基硫代吡喃-3,5-二酮 (32.9 毫克)。

實施例 29: 4-(2',4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基-1,1-二酮基硫代吡喃-3,5-二酮之製備



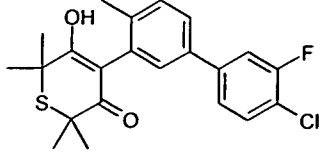
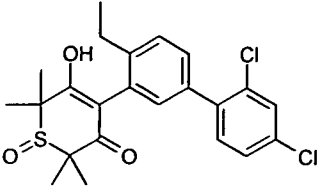
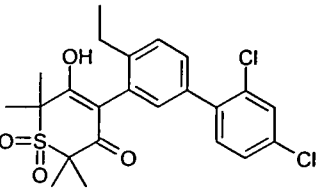
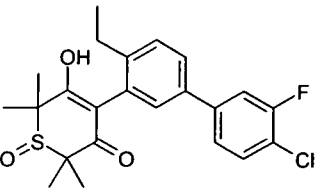
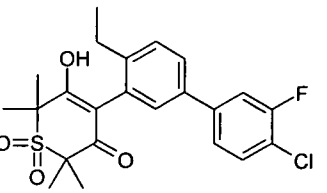
將在甲醇 / 水 (1 毫升, 1:1 之比) 中成為溶液的 4-(2',4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基硫代吡喃-3,5-二酮 (79 毫克, 0.1819 毫莫耳) 與 oxone (446 毫克,

0.726 毫莫耳) 之混合物在周圍溫度下攪拌 20 小時。接著將反應混合物分溶在水與二氯甲烷之間，將有機相分開及在減壓下濃縮。將殘餘物以製備性反相 HPLC 純化，得到成為澄清膠的 4-(2',4'-二氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基-1,1-二酮基硫代吡喃-3,5-二酮 (24.6 毫克)。

在表 C 中的額外化合物係以類似的步驟從適當的原料所製備。

表 C

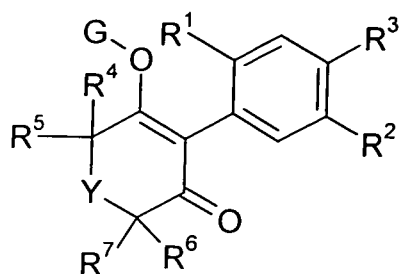
化合物編號	結構	^1H nmr (CDCl_3 , 除非有另外陳述) 或其他的物理數據
C-1		δ 7.55 (dd, 1H), 7.51-7.48 (m, 2H), 7.43-7.38 (m, 1H), 7.43-7.38 (m, 2H), 7.21 (d, 1H), 5.42 (br.s, 1H), 2.53-2.42 (m, 2H), 1.72 (app. d, 6H), 1.60 (app. d, 6H), 1.15 (t, 3H).
C-2		δ 7.58 (dd, 1H), 7.50 (d, 2H), 7.40 (d, 2H), 7.46 (d, 1H), 7.18 (d, 1H), 2.48 (m, 2H), 1.69 (s, 12H), 1.16 (t, 3H).
C-3		δ 7.60 (dd, 1H), 7.49 (d, 2H), 7.46 (d, 1H), 7.40 (d, 2H), 7.23 (d, 1H), 5.78 (s, 1H), 2.44 (m, 2H), 1.86 (s, 6H), 1.74 (s, 6H), 1.15 (t, 3H).
C-4		δ 7.52-7.31 (m, 5H), 7.14 (s, 0.65H, 異構物 A), 7.08 (s, 0.25H, 異構物 B), 5.87 (br. s, 0.25H, 異構物 B), 5.67 (br. s, 0.65H, 異構物 A), 2.62-2.48 (m, 2H), 1.76-1.59 (m, 12H), 1.28-1.19 (m, 3H)
C-5		δ 7.59-7.31 (m, 5H); 7.25 (d, 0.7H, 異構物 A), 7.19 (d, 0.3H, 異構物 B), 5.90 (br. s, 0.3H, 異構物 B), 5.54 (br. s, 0.7H, 異構物 A), 2.62-2.47 (m, 2H); 1.17-1.61 (m, 12H); 1.26-1.18 (m, 3H)
C-6		甲醇- d_4 δ 7.55 (s, 1H); 7.40 (s, 2H); 7.35 (s, 2H); 7.03 (s, 1H); 2.18 (s, 3H); 1.65 (s, 6H), 1.60 (s, 6H)
C-7		甲醇- d_4 δ 7.53 (s, 1H), 7.36 (s, 2H), 7.34 (s, 2H), 7.09 (s, 0.5H, 異構物 A), 7.00 (s, 0.5H, 異構物 B), 2.16 (s, 1.5H, 異構物 A or B), 2.13 (s, 1.5H, 異構物 A or B), 1.69 (s, 3H, 異構物 A or B), 1.67 (s, 3H, 異構物 A or B), 1.62 (s, 6H, 異構物 A 和 B)
C-8		甲醇- d_4 δ 7.53 (s, 1H); 7.37 (s, 2H), 7.33 (s, 2H), 7.03 (s, 1H); 2.13 (s, 3H); 1.72 (s, 12H)

C-9		δ 7.50-7.15 (m, 6H); 5.75 (br. s, 1H), 2.23 (s, 1H, 異構物 A), 2.18 (s, 2H, 異構物 B), 1.65 (br. s, 12H)
C-10		δ 7.51 (s, 1H); 7.46 (s, 2H); 7.33 (s, 2H), 7.16 (s, 0.5H, 異構物 A), 7.09 (s, 0.5H, 異構物 B), 6.16 (br. s, 1H), 2.55-2.45 (m, 2H); 1.76 (app. d, 6H); 1.62 (app. d, 6H); 1.20 (m, 3H)
C-11		δ 7.48 (s, 1H); 7.45 (s, 2H); 7.31 (s, 2H); 7.12 (s, 1H); 6.04 (br. s, 1H), 2.50-2.41 (m, 2H); 1.85 (s, 6H); 1.72 (app. d, 6H); 1.16 (t, 3H)
C-12		δ 7.56 (dd, 1H); 7.47-7.41 (m, 2H); 7.37-7.28 (m, 2.5H); 7.16 (d, 0.5H); 2.49-2.39 (m, 2H); 1.68 (app. d, 12H); 1.17-1.12 (m, 3H)
C-13		δ 7.59 (dd, 1H); 7.47-7.44 (m, 2H); 7.35 (dd, 1H); 7.30 (dd, 1H); 7.22 (d, 1H); 5.84 (br. s, 1H), 2.49-2.40 (m, 2H); 1.87 (app. d, 6H); 1.73 (s, 6H); 1.14 (t, 3H)

下列表 1 至 294 的化合物可以類似的方式獲得。

表 1：

該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如下述所定義。

化合物編號	R^2	R^3
1.001	苯基	H
1.002	2-氟苯基	H
1.003	3-氟苯基	H
1.004	4-氟苯基	H
1.005	2-氯苯基	H
1.006	3-氯苯基	H
1.007	4-氯苯基	H
1.008	2-溴苯基	H
1.009	3-溴苯基	H
1.010	4-溴苯基	H
1.011	4-第三丁基	H
1.012	2-碘苯基	H

1.013	3-碘苯基	H
1.014	4-碘苯基	H
1.015	2-甲苯基	H
1.016	3-甲苯基	H
1.017	4-甲苯基	H
1.018	2-氟苯基	H
1.019	3-氟苯基	H
1.020	4-氟苯基	H
1.021	2-甲氧基苯基	H
1.022	3-甲氧基苯基	H
1.023	4-甲氧基苯基	H
1.024	2-二氟甲氧基苯基	H
1.025	3-二氟甲氧基苯基	H
1.026	4-二氟甲氧基苯基	H
1.027	2-二氟甲基苯基	H
1.028	3-二氟甲基苯基	H
1.029	4-二氟甲基苯基	H
1.030	2-三氟甲基苯基	H
1.031	3-三氟甲基苯基	H
1.032	4-三氟甲基苯基	H
1.033	2-三氟甲氧基苯基	H
1.034	3-三氟甲氧基苯基	H
1.035	4-三氟甲氧基苯基	H
1.036	4-甲硫基苯基	H

1.037	4-甲基亞磺醯基苯基	H
1.038	4-甲基磺醯基苯基	H
1.039	4-三氟甲硫基苯基	H
1.040	4-三氟甲基亞磺醯基苯基	H
1.041	4-三氟甲基磺醯基苯基	H
1.042	2,3-二氟苯基	H
1.043	2,4-二氟苯基	H
1.044	2,5-二氟苯基	H
1.045	2,6-二氟苯基	H
1.046	3,4-二氟苯基	H
1.047	3,5-二氟苯基	H
1.048	2,3-二氯苯基	H
1.049	2,4-二氯苯基	H
1.050	2,5-二氯苯基	H
1.051	2,6-二氯苯基	H
1.052	3,4-二氯苯基	H
1.053	3,4-二氯苯基	H
1.054	4-氯基-2-氟苯基	H
1.055	4-氯基-3-氟苯基	H
1.056	4-氯基-2-氟苯基	H
1.057	4-氯基-3-氟苯基	H
1.058	4-氯基-2-甲氧基苯基	H
1.059	4-氯基-3-甲氧基苯基	H
1.060	4-氯基-2-甲苯基	H

1.061	4-氯基-3-甲基苯基	H
1.062	4-氯基-2-二氟甲氧基苯基	H
1.063	4-氯基-3-二氟甲氧基苯基	H
1.064	4-氯基-2-三氟甲氧基苯基	H
1.065	4-氯基-3-三氟甲氧基苯基	H
1.066	4-氯基-2-二氟甲基苯基	H
1.067	4-氯基-3-二氟甲基苯基	H
1.068	4-氯基-2-三氟甲基苯基	H
1.069	4-氯基-3-三氟甲基苯基	H
1.070	4-氯基-2,3-二氟苯基	H
1.071	4-氯基-2,5-二氟苯基	H
1.072	4-氯基-2,6-二氟苯基	H
1.073	2,4-二氯基-3-氟苯基	H
1.074	2,4-二氯基-5-氟苯基	H
1.075	2,4-二氯基-6-氟苯基	H
1.076	2,3,4-三氯苯基	H
1.077	2,3,5-三氯苯基	H
1.078	2,3,6-三氯苯基	H
1.079	2,4,5-三氯苯基	H
1.080	2,4,6-三氯苯基	H
1.081	2,3,4-三氟苯基	H
1.082	2,3,5-三氟苯基	H
1.083	2,3,6-三氟苯基	H
1.084	2,4,5-三氟苯基	H

1.085	2,4,6-三氟苯基	H
1.086	2-氟基-4-三氟甲基	H
1.087	3-氟基-4-三氟甲基	H
1.088	2-氯基吡啶-5-基	H
1.089	3-氯基吡啶-5-基	H
1.090	2-甲基吡啶-5-基	H
1.091	3-甲基吡啶-5-基	H
1.092	2-三氟甲基吡啶-5-基	H
1.093	3-三氟甲基吡啶-5-基	H
1.094	2-氯基-3-甲基吡啶-5-基	H
1.095	2-氯基-4-甲基吡啶-5-基	H
1.096	6-氯基-2-甲基吡啶-3-基	H
1.097	2,3-二氯基吡啶-5-基	H
1.098	2,4-二氯基吡啶-5-基	H
1.099	2,6-二氯基吡啶-3-基	H
1.100	吡啶-2-基	H
1.101	2-氯基吡啶-5-基	H
1.102	2-溴基吡啶-5-基	H
1.103	嗒啶-3-基	H
1.104	6-溴基嗒啶-3-基	H
1.105	6-氯基嗒啶-3-基	H
1.106	嘧啶-5-基	H
1.107	2-溴基嘧啶-5-基	H
1.108	5-溴基嘧啶-2-基	H

1.109	2-氯基嘧啶-5-基	H
1.110	5-氯基嘧啶-2-基	H
1.111	2-呋喃基	H
1.112	3-呋喃基	H
1.113	2-噻吩基	H
1.114	3-噻吩基	H
1.115	4-溴基噻吩-2-基	H
1.116	5-溴基噻吩-2-基	H
1.117	4-氯基噻吩-2-基	H
1.118	5-氯基噻吩-2-基	H
1.119	吡唑-1-基	H
1.120	3-氯基吡唑-1-基	H
1.121	4-氯基吡唑-1-基	H
1.122	1-甲基吡唑-4-基	H
1.123	1-甲基-3-三氟甲基吡唑-5-基	H
1.124	2-噻唑基	H
1.125	4-甲基噻唑-2-基	H
1.126	5-甲基噻唑-2-基	H
1.127	苯基	CH ₃
1.128	2-氯苯基	CH ₃
1.129	3-氯苯基	CH ₃
1.130	4-氯苯基	CH ₃
1.131	2-氯苯基	CH ₃
1.132	3-氯苯基	CH ₃

1.133	4-氯苯基	CH ₃
1.134	2-溴苯基	CH ₃
1.135	3-溴苯基	CH ₃
1.136	4-溴苯基	CH ₃
1.137	4-第三丁基	CH ₃
1.138	2-碘苯基	CH ₃
1.139	3-碘苯基	CH ₃
1.140	4-碘苯基	CH ₃
1.141	2-甲基苯基	CH ₃
1.142	3-甲基苯基	CH ₃
1.143	4-甲基苯基	CH ₃
1.144	2-氟苯基	CH ₃
1.145	3-氟苯基	CH ₃
1.146	4-氟苯基	CH ₃
1.147	2-甲氧基苯基	CH ₃
1.148	3-甲氧基苯基	CH ₃
1.149	4-甲氧基苯基	CH ₃
1.150	2-二氟甲氧基苯基	CH ₃
1.151	3-二氟甲氧基苯基	CH ₃
1.152	4-二氟甲氧基苯基	CH ₃
1.153	2-二氟甲基苯基	CH ₃
1.154	3-二氟甲基苯基	CH ₃
1.155	4-二氟甲基苯基	CH ₃
1.156	2-三氟甲基苯基	CH ₃

1.157	3-三氟甲基苯基	CH ₃
1.158	4-三氟甲基苯基	CH ₃
1.159	2-三氟甲氧基苯基	CH ₃
1.160	3-三氟甲氧基苯基	CH ₃
1.161	4-三氟甲氧基苯基	CH ₃
1.162	4-甲硫基苯基	CH ₃
1.163	4-甲基亞磺醯基苯基	CH ₃
1.164	4-甲基磺醯基苯基	CH ₃
1.165	4-三氟甲硫基苯基	CH ₃
1.166	4-三氟甲基亞磺醯基苯基	CH ₃
1.167	4-三氟甲基磺醯基苯基	CH ₃
1.168	2,3-二氟苯基	CH ₃
1.169	2,4-二氟苯基	CH ₃
1.170	2,5-二氟苯基	CH ₃
1.170	2,6-二氟苯基	CH ₃
1.172	3,4-二氟苯基	CH ₃
1.173	3,5-二氟苯基	CH ₃
1.174	2,3-二氯苯基	CH ₃
1.175	2,4-二氯苯基	CH ₃
1.176	2,5-二氯苯基	CH ₃
1.177	2,6-二氯苯基	CH ₃
1.178	3,4-二氯苯基	CH ₃
1.179	3,4-二氯苯基	CH ₃
1.180	4-氯基-2-氯苯基	CH ₃

1.181	4-氯基-3-氟苯基	CH ₃
1.182	4-氯基-2-氟苯基	CH ₃
1.183	4-氯基-3-氟苯基	CH ₃
1.184	4-氯基-2-甲氧基苯基	CH ₃
1.185	4-氯基-3-甲氧基苯基	CH ₃
1.186	4-氯基-2-甲苯基	CH ₃
1.187	4-氯基-3-甲苯基	CH ₃
1.188	4-氯基-2-二氟甲氧基苯基	CH ₃
1.189	4-氯基-3-二氟甲氧基苯基	CH ₃
1.190	4-氯基-2-三氟甲氧基苯基	CH ₃
1.191	4-氯基-3-三氟甲氧基苯基	CH ₃
1.192	4-氯基-2-二氟甲苯基	CH ₃
1.193	4-氯基-3-二氟甲苯基	CH ₃
1.194	4-氯基-2-三氟甲苯基	CH ₃
1.195	4-氯基-3-三氟甲苯基	CH ₃
1.196	4-氯基-2,3-二氟苯基	CH ₃
1.197	4-氯基-2,5-二氟苯基	CH ₃
1.198	4-氯基-2,6-二氟苯基	CH ₃
1.199	2,4-二氯基-3-氟苯基	CH ₃
1.200	2,4-二氯基-5-氟苯基	CH ₃
1.201	2,4-二氯基-6-氟苯基	CH ₃
1.202	2,3,4-三氯苯基	CH ₃
1.203	2,3,5-三氯苯基	CH ₃
1.204	2,3,6-三氯苯基	CH ₃

1.205	2,4,5-三氯苯基	CH ₃
1.206	2,4,6-三氯苯基	CH ₃
1.207	2,3,4-三氯苯基	CH ₃
1.208	2,3,5-三氯苯基	CH ₃
1.209	2,3,6-三氯苯基	CH ₃
1.210	2,4,5-三氯苯基	CH ₃
1.211	2,4,6-三氯苯基	CH ₃
1.212	2-氯基-4-三氯甲基苯基	CH ₃
1.213	3-氯基-4-三氯甲基苯基	CH ₃
1.214	2-氯基吡啶-5-基	CH ₃
1.215	3-氯基吡啶-5-基	CH ₃
1.216	2-甲基吡啶-5-基	CH ₃
1.217	3-甲基吡啶-5-基	CH ₃
1.218	2-三氯甲基吡啶-5-基	CH ₃
1.219	3-三氯甲基吡啶-5-基	CH ₃
1.220	2-氯基-3-甲基吡啶-5-基	CH ₃
1.221	2-氯基-4-甲基吡啶-5-基	CH ₃
1.222	6-氯基-2-甲基吡啶-3-基	CH ₃
1.223	2,3-二氯基吡啶-5-基	CH ₃
1.224	2,4-二氯基吡啶-5-基	CH ₃
1.225	2,6-二氯基吡啶-3-基	CH ₃
1.226	吡啶-2-基	CH ₃
1.227	2-氯基吡啶-5-基	CH ₃
1.228	2-溴基吡啶-5-基	CH ₃

1.229	嗒 咩 -3-基	CH ₃
1.230	6-溴基 嗒 咩 -3-基	CH ₃
1.231	6-氯基 嗒 咩 -3-基	CH ₃
1.232	嘓 啖 -5-基	CH ₃
1.233	2-溴基 嘓 啖 -5-基	CH ₃
1.234	5-溴基 嘓 啖 -2-基	CH ₃
1.235	2-氯基 嘓 啖 -5-基	CH ₃
1.236	5-氯基 嘓 啖 -2-基	CH ₃
1.237	2-呋喃基	CH ₃
1.238	3-呋喃基	CH ₃
1.239	2-噻吩基	CH ₃
1.240	3-噻吩基	CH ₃
1.241	4-溴基 噻 吩 -2-基	CH ₃
1.242	5-溴基 噻 吩 -2-基	CH ₃
1.243	4-氯基 噻 吩 -2-基	CH ₃
1.244	5-氯基 噻 吩 -2-基	CH ₃
1.245	吡 啶 -1-基	CH ₃
1.246	3-氯基 吡 啶 -1-基	CH ₃
1.247	4-氯基 吡 啶 -1-基	CH ₃
1.248	1-甲基 吡 啶 -4-基	CH ₃
1.249	1-甲基-3-三氯甲基 吡 啶 -5-基	CH ₃
1.250	2-噻 啶 基	CH ₃
1.251	4-甲基 噻 啶 -2-基	CH ₃
1.252	5-甲基 噻 啶 -2-基	CH ₃

1.253	苯基	C1
1.254	2-氟苯基	C1
1.255	3-氟苯基	C1
1.256	4-氟苯基	C1
1.257	2-氯苯基	C1
1.258	3-氯苯基	C1
1.259	4-氯苯基	C1
1.260	2-溴苯基	C1
1.261	3-溴苯基	C1
1.262	4-溴苯基	C1
1.263	4-第三丁基	C1
1.264	2-碘苯基	C1
1.265	3-碘苯基	C1
1.266	4-碘苯基	C1
1.267	2-甲基苯基	C1
1.268	3-甲基苯基	C1
1.269	4-甲基苯基	C1
1.270	2-氰苯基	C1
1.271	3-氰苯基	C1
1.272	4-氰苯基	C1
1.273	2-甲氧基苯基	C1
1.274	3-甲氧基苯基	C1
1.275	4-甲氧基苯基	C1
1.276	2-二氟甲氧基苯基	C1

1.277	3-二氟甲氧基苯基	C1
1.278	4-二氟甲氧基苯基	C1
1.279	2-二氟甲基苯基	C1
1.280	3-二氟甲基苯基	C1
1.281	4-二氟甲基苯基	C1
1.282	2-三氟甲基苯基	C1
1.283	3-三氟甲基苯基	C1
1.284	4-三氟甲基苯基	C1
1.285	2-三氟甲氧基苯基	C1
1.286	3-三氟甲氧基苯基	C1
1.287	4-三氟甲氧基苯基	C1
1.288	4-甲硫基苯基	C1
1.289	4-甲基亞磺醯基苯基	C1
1.290	4-甲基磺醯基苯基	C1
1.291	4-三氟甲硫基苯基	C1
1.292	4-三氟甲基亞磺醯基苯基	C1
1.293	4-三氟甲基磺醯基苯基	C1
1.294	2,3-二氟苯基	C1
1.295	2,4-二氟苯基	C1
1.296	2,5-二氟苯基	C1
1.297	2,6-二氟苯基	C1
1.298	3,4-二氟苯基	C1
1.299	3,5-二氟苯基	C1
1.300	2,3-二氟苯基	C1

1.301	2,4-二氯苯基	C1
1.302	2,5-二氯苯基	C1
1.303	2,6-二氯苯基	C1
1.304	3,4-二氯苯基	C1
1.305	3,4-二氯苯基	C1
1.306	4-氯基-2-氟苯基	C1
1.307	4-氯基-3-氟苯基	C1
1.308	4-氯基-2-氟苯基	C1
1.309	4-氯基-3-氟苯基	C1
1.310	4-氯基-2-甲氧基苯基	C1
1.311	4-氯基-3-甲氧基苯基	C1
1.312	4-氯基-2-甲基苯基	C1
1.313	4-氯基-3-甲基苯基	C1
1.314	4-氯基-2-二氟甲氧基苯基	C1
1.315	4-氯基-3-二氟甲氧基苯基	C1
1.316	4-氯基-2-三氟甲氧基苯基	C1
1.317	4-氯基-3-三氟甲氧基苯基	C1
1.318	4-氯基-2-二氟甲基苯基	C1
1.319	4-氯基-3-二氟甲基苯基	C1
1.320	4-氯基-2-三氟甲基苯基	C1
1.321	4-氯基-3-三氟甲基苯基	C1
1.322	4-氯基-2,3-二氟苯基	C1
1.323	4-氯基-2,5-二氟苯基	C1
1.324	4-氯基-2,6-二氟苯基	C1

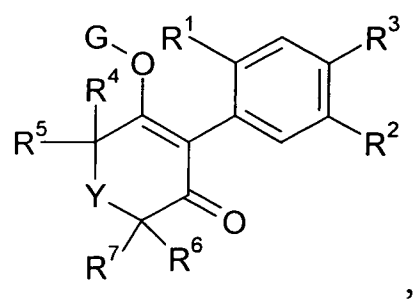
1.325	2,4-二氯基-3-氟苯基	C1
1.326	2,4-二氯基-5-氟苯基	C1
1.327	2,4-二氯基-6-氟苯基	C1
1.328	2,3,4-三氯苯基	C1
1.329	2,3,5-三氯苯基	C1
1.330	2,3,6-三氯苯基	C1
1.331	2,4,5-三氯苯基	C1
1.332	2,4,6-三氯苯基	C1
1.333	2,3,4-三氟苯基	C1
1.334	2,3,5-三氟苯基	C1
1.335	2,3,6-三氟苯基	C1
1.336	2,4,5-三氟苯基	C1
1.337	2,4,6-三氟苯基	C1
1.338	2-氟基-4-三氟甲苯基	C1
1.339	3-氟基-4-三氟甲苯基	C1
1.340	2-氯基吡啶-5-基	C1
1.341	3-氯基吡啶-5-基	C1
1.342	2-甲基吡啶-5-基	C1
1.343	3-甲基吡啶-5-基	C1
1.344	2-三氟甲基吡啶-5-基	C1
1.345	3-三氟甲基吡啶-5-基	C1
1.346	2-氯基-3-甲基吡啶-5-基	C1
1.347	2-氯基-4-甲基吡啶-5-基	C1
1.348	6-氯基-2-甲基吡啶-3-基	C1

1.349	2,3-二氯基吡啶-5-基	C1
1.350	2,4-二氯基吡啶-5-基	C1
1.351	2,6-二氯基吡啶-3-基	C1
1.352	吡咩-2-基	C1
1.353	2-氯基吡咩-5-基	C1
1.354	2-溴基吡咩-5-基	C1
1.355	嗒咩-3-基	C1
1.356	6-溴基嗒咩-3-基	C1
1.357	6-氯基嗒咩-3-基	C1
1.358	嘍啶-5-基	C1
1.359	2-溴基嘍啶-5-基	C1
1.360	5-溴基嘍啶-2-基	C1
1.361	2-氯基嘍啶-5-基	C1
1.362	5-氯基嘍啶-2-基	C1
1.363	2-呋喃基	C1
1.364	3-呋喃基	C1
1.365	2-噻吩基	C1
1.366	3-噻吩基	C1
1.367	4-溴基噻吩-2-基	C1
1.368	5-溴基噻吩-2-基	C1
1.369	4-氯基噻吩-2-基	C1
1.370	5-氯基噻吩-2-基	C1
1.371	吡唑-1-基	C1
1.372	3-氯基吡唑-1-基	C1

1.373	4-氯基吡唑-1-基	C1
1.374	1-甲基吡唑-4-基	C1
1.375	1-甲基-3-三氟甲基吡唑-5-基	C1
1.376	2-噻唑基	C1
1.377	4-甲基噻唑-2-基	C1
1.378	5-甲基噻唑-2-基	C1

表 2：

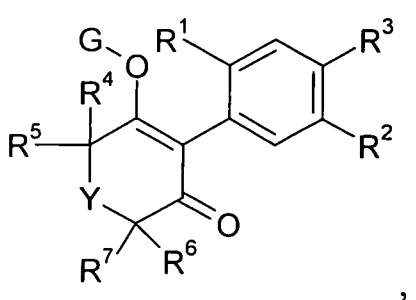
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 3：

該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：

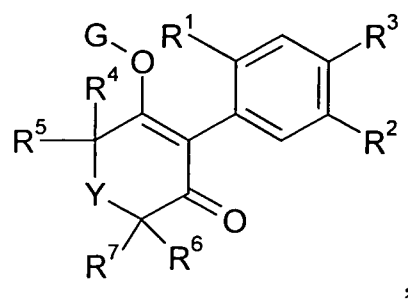


其中 Y 為 O，R¹ 為氯，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，

而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 4：

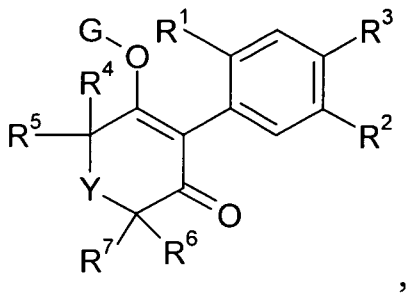
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為甲基， R^4 為甲基， R^5 、 R^6 及 R^7 為氫，
G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 5：

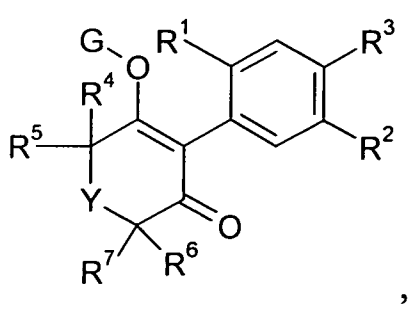
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為乙基， R^4 為甲基， R^5 、 R^6 及 R^7 為氫，
G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 6：

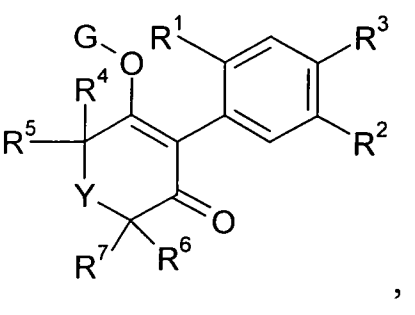
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為氯，R⁴ 為甲基，R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 7：

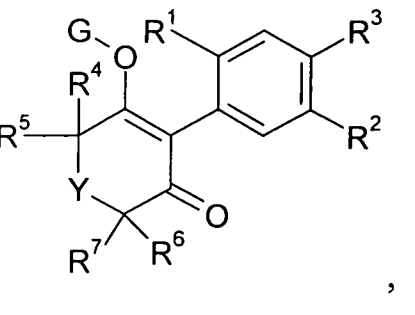
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為甲基，R⁴ 及 R⁵ 甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 8：

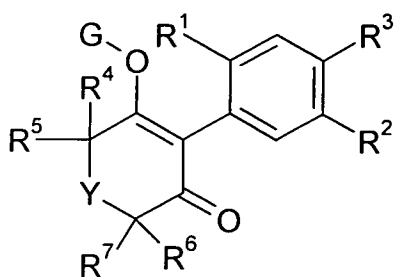
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為乙基， R^4 及 R^5 甲基， R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 9：

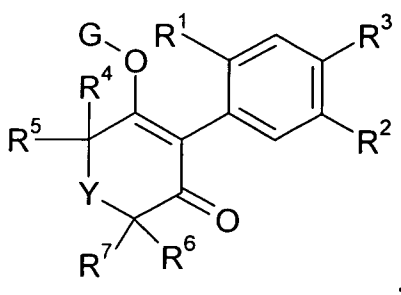
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為氯， R^4 及 R^5 甲基， R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 10：

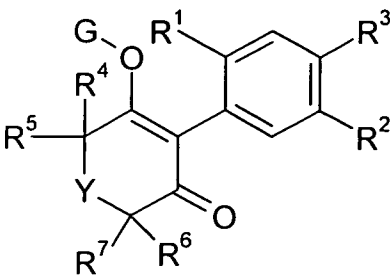
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為甲基， R^4 及 R^6 甲基， R^5 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 11：

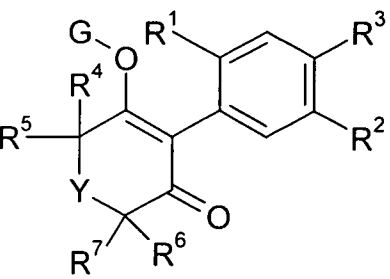
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為乙基，R⁴ 及 R⁶ 甲基，R⁵ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 12：

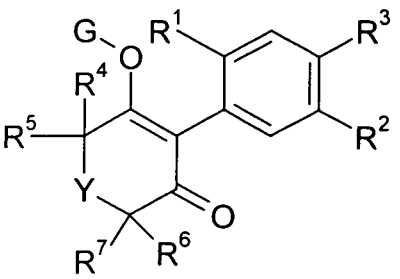
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為氯，R⁴ 及 R⁶ 甲基，R⁵ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 13：

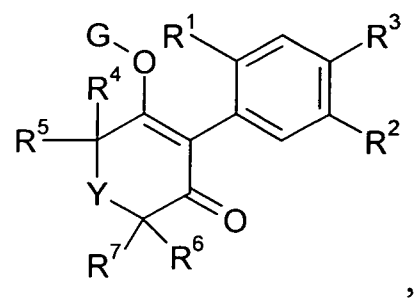
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為甲基，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 14：

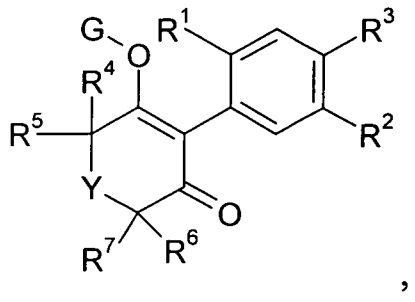
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 15：

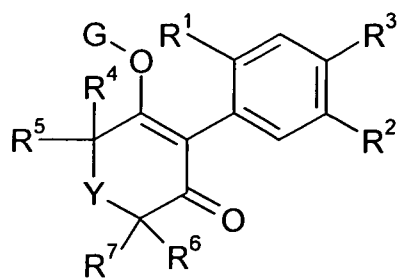
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為氯，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 16：

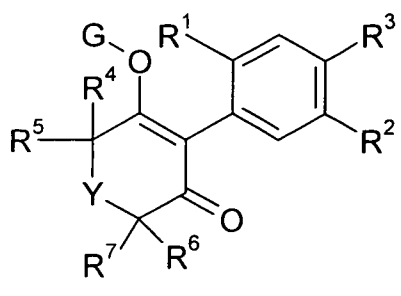
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為甲基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 17：

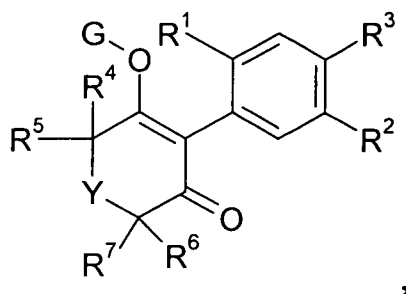
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 18：

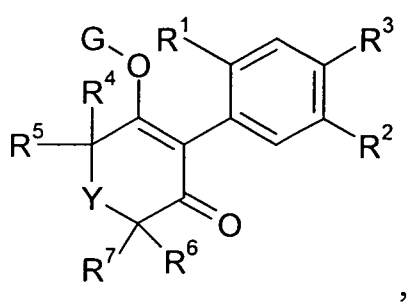
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為 氯，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為 甲基，G 為 氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 19：

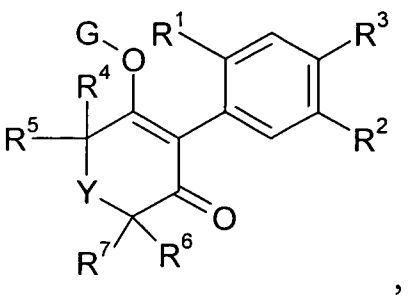
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為 甲基，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為 甲基，R⁷ 為 甲氧基甲基，G 為 氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 20：

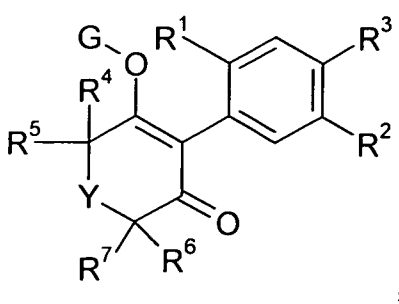
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為 乙基，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為 甲基，R⁷ 為 甲氧基甲基，G 為 氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 21：

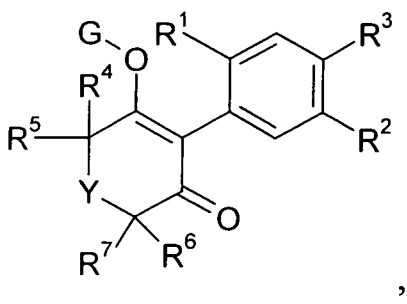
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為氯，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R⁷ 為甲氧基
甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 22：

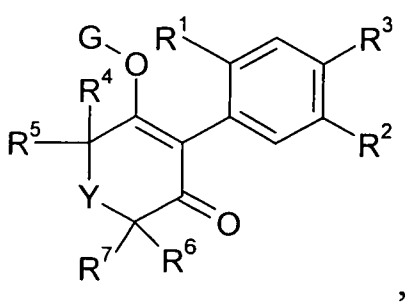
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為甲基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，
而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 23：

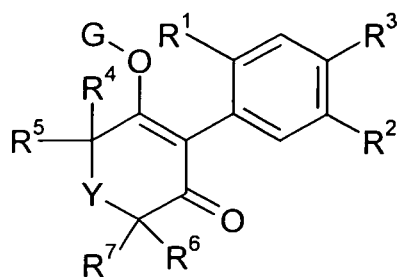
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 24：

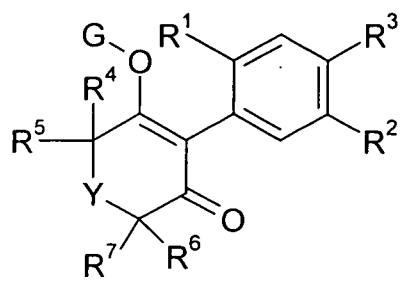
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為氯，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 25：

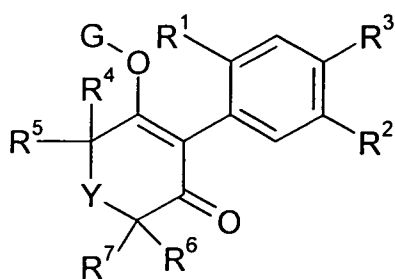
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為甲基，R⁴ 為甲基，R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 26：

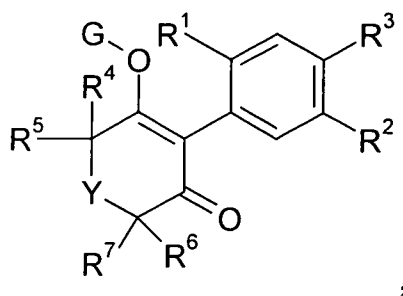
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為乙基，R⁴ 為甲基，R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 27：

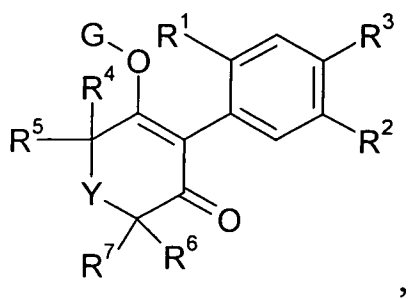
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為氫，R⁴ 為甲基，R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 28：

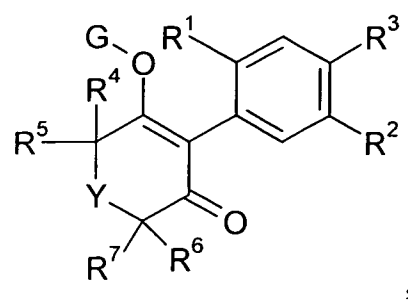
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為甲基，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 29：

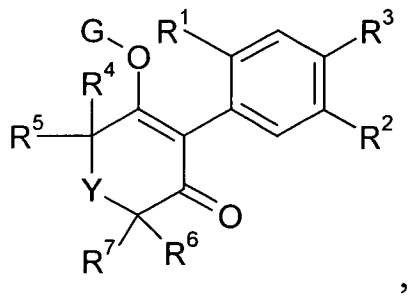
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為乙基，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 30：

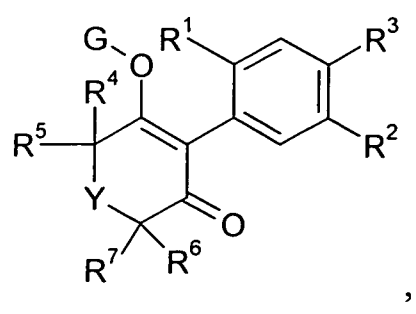
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為氯，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 31：

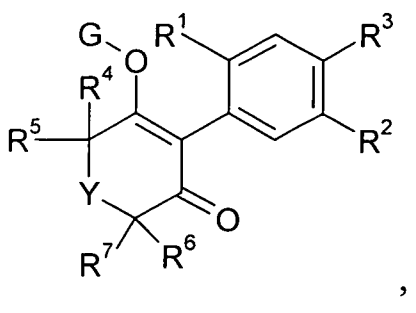
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為甲基，R⁴ 及 R⁶ 為甲基，R⁵ 及 R⁷ 為氫，
G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 32：

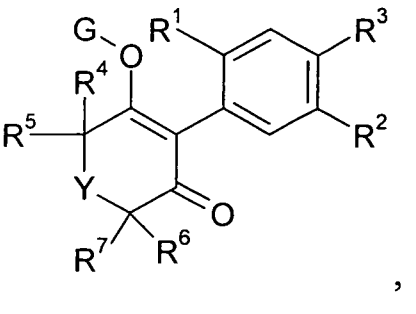
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為乙基，R⁴ 及 R⁶ 為甲基，R⁵ 及 R⁷ 為氫，
G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 33：

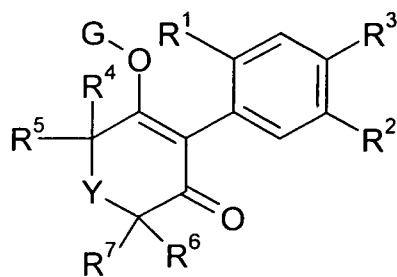
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為氯， R^4 及 R^6 為甲基， R^5 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 34：

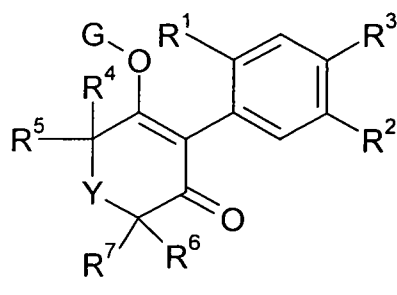
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為甲基， R^4 、 R^5 及 R^6 為甲基，及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 35：

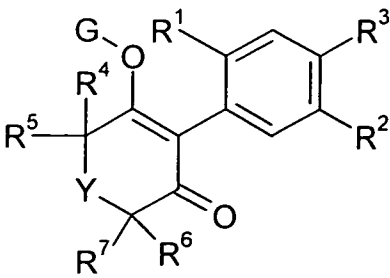
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為乙基， R^4 、 R^5 及 R^6 為甲基， R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 36：

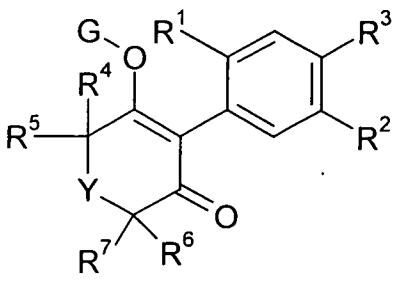
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為氯，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 37：

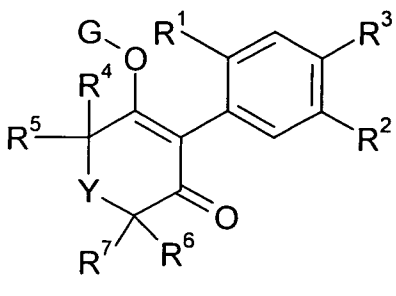
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為甲基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 38：

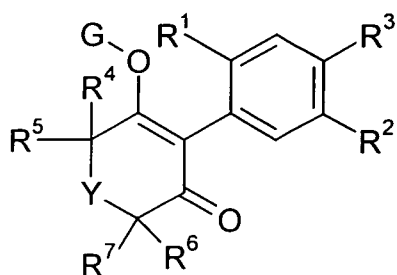
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 39：

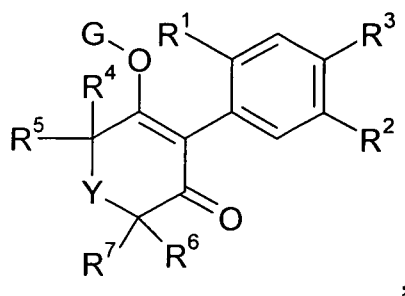
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為氯，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 40：

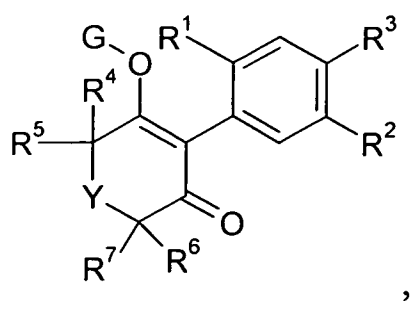
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為甲基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 41：

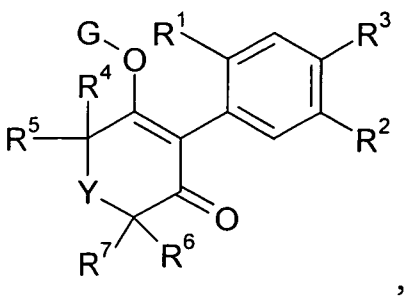
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 42：

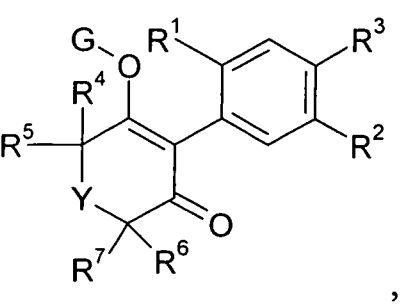
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為氯，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 43：

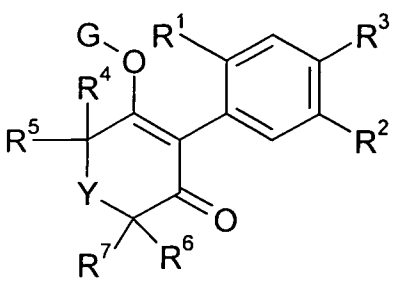
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為 甲基，R⁴ 為 甲基，R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為 氫，
G 為 氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 44：

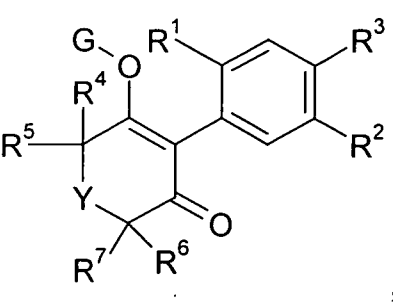
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為 乙基，R⁴ 為 甲基，R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為 氫，
G 為 氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 45：

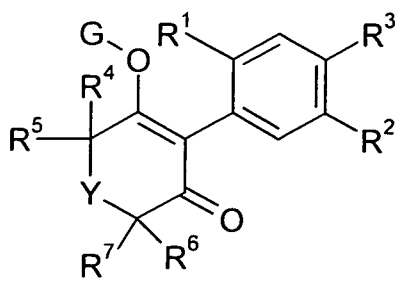
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為 氯，R⁴ 為 甲基，R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為 氫，
G 為 氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 46：

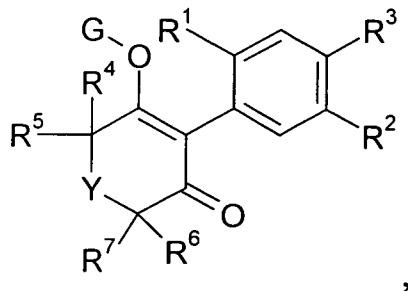
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為甲基，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，
G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 47：

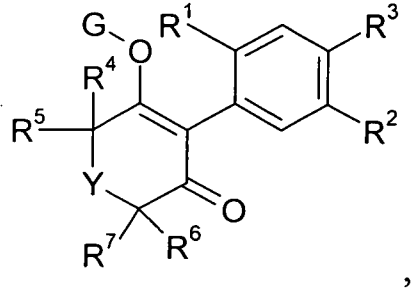
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，
G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 48：

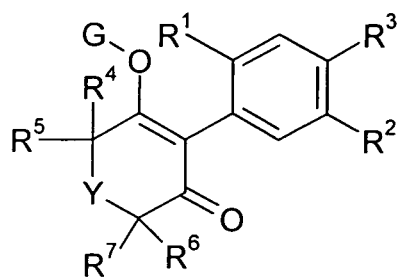
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為氯，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 49：

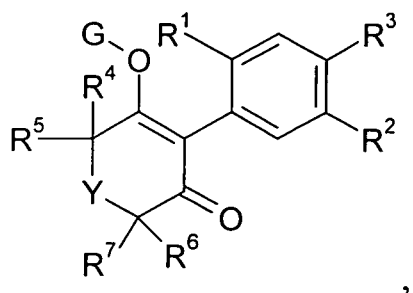
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為甲基，R⁴ 及 R⁶ 為甲基，R⁵ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 50：

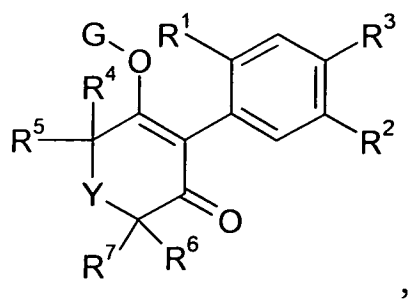
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁴ 及 R⁶ 為甲基，R⁵ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 51：

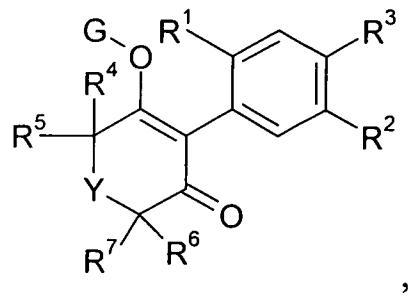
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為氯，R⁴ 及 R⁶ 為甲基，R⁵ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 52：

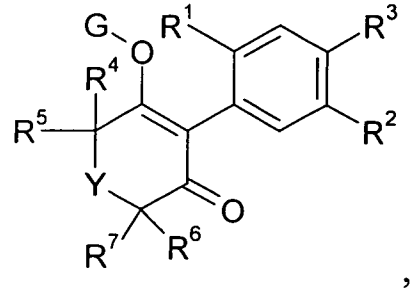
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為甲基，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為甲基，及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 53：

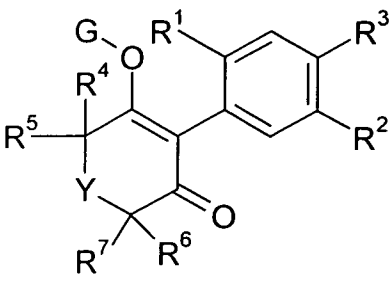
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 54：

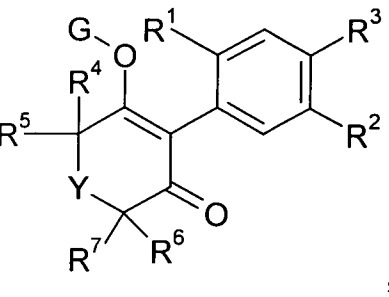
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為氯，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 55：

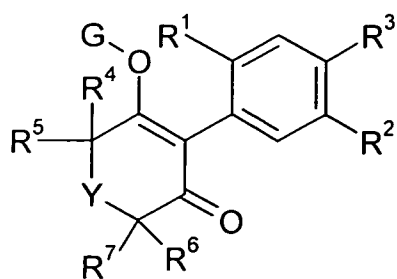
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為甲基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 56：

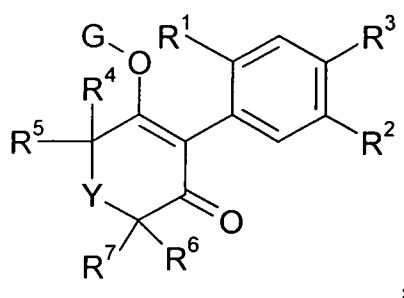
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 57：

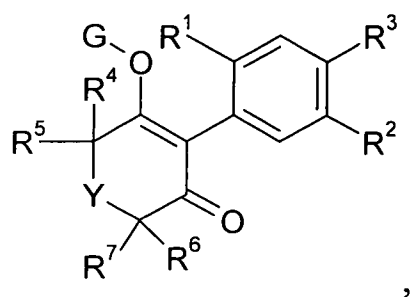
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為氯，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 58：

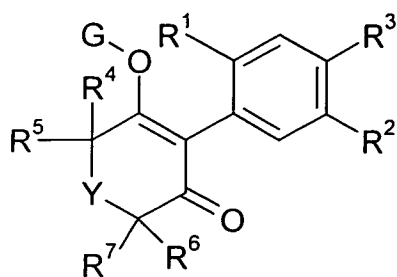
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 59：

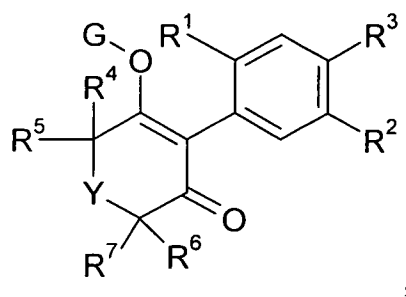
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 60：

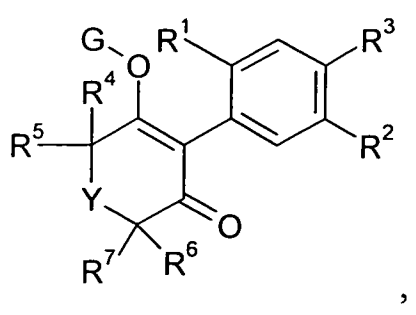
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為氯， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 61：

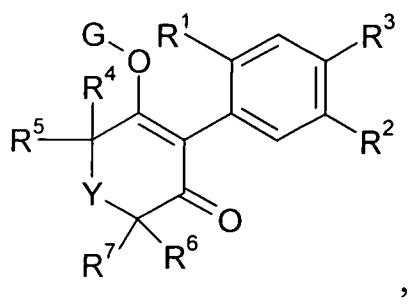
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為甲基， R^4 為甲基， R^5 、 R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 62：

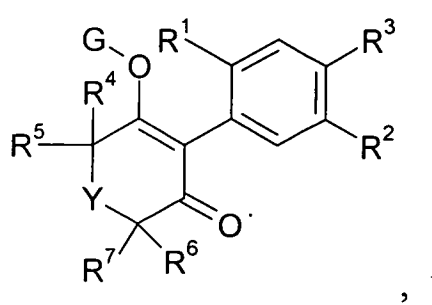
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^4 為甲基， R^5 、 R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 63：

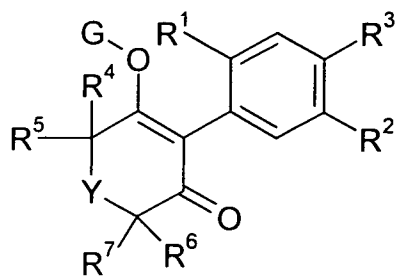
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為氯， R^4 為甲基， R^5 、 R^6 及 R^7 為氫，
G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 64：

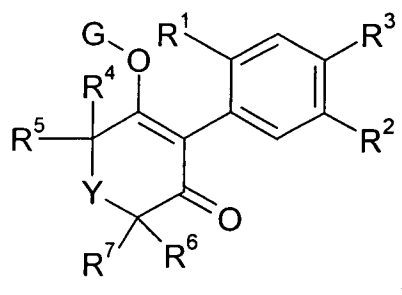
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為甲基， R^4 及 R^5 為甲基， R^6 及 R^7
為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 65：

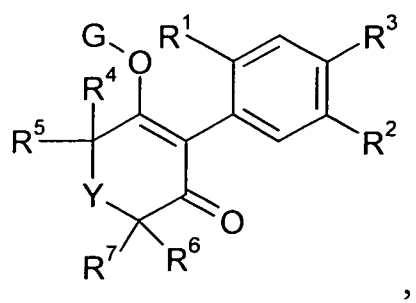
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^4 及 R^5 為甲基， R^6 及 R^7
為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 66：

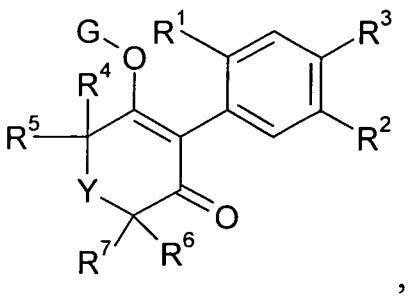
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為氯， R^4 及 R^5 為甲基， R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 67：

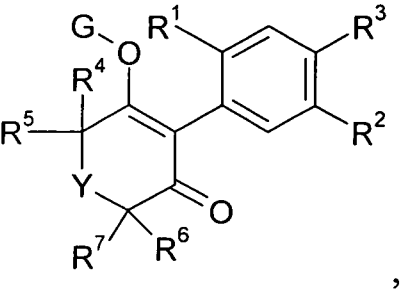
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為甲基， R^4 及 R^6 為甲基， R^5 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 68：

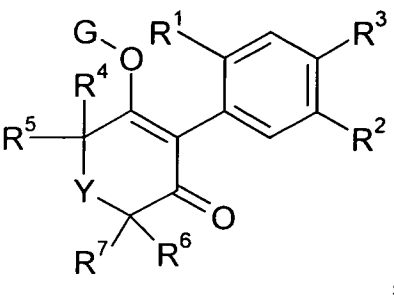
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^4 及 R^6 為甲基， R^5 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 69：

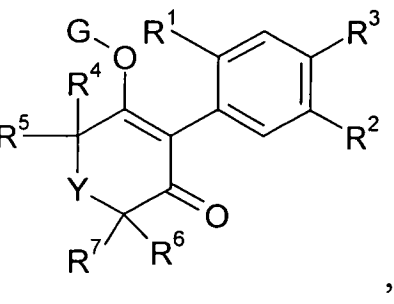
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為氯， R^4 及 R^6 為甲基， R^5 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 70：

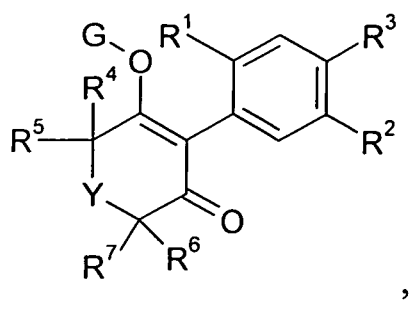
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為甲基， R^4 、 R^5 及 R^6 為甲基，及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 71：

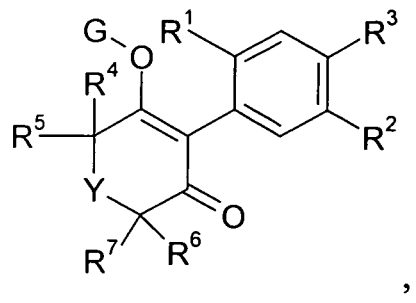
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^4 、 R^5 及 R^6 為甲基， R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 72：

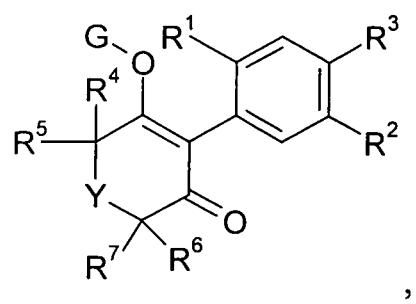
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為氯， R^4 、 R^5 及 R^6 為甲基， R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 73：

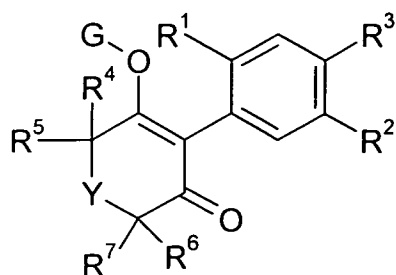
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基，
G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 74：

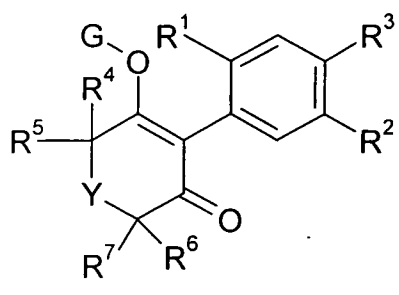
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基，
G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 75：

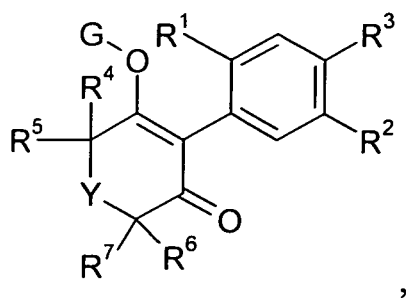
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為氯， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基，G
為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 76：

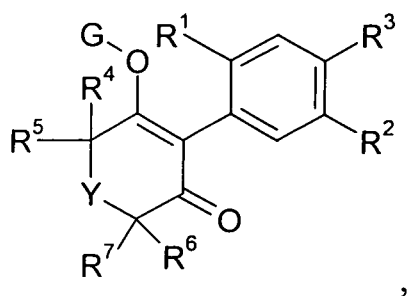
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為甲基，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 77：

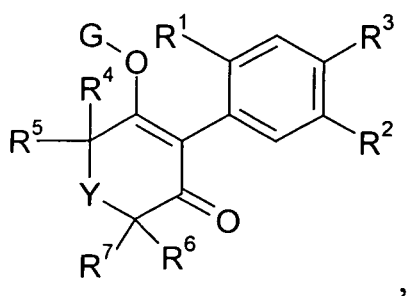
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 78：

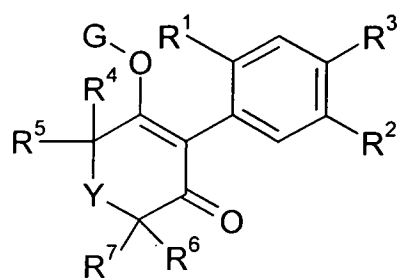
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 79：

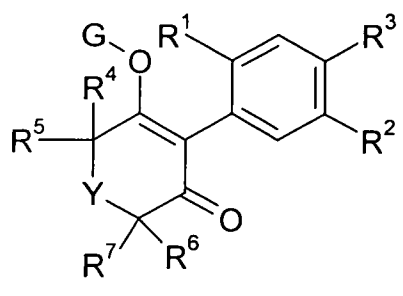
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為甲基，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 80：

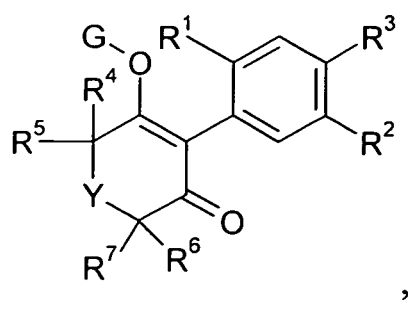
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 81：

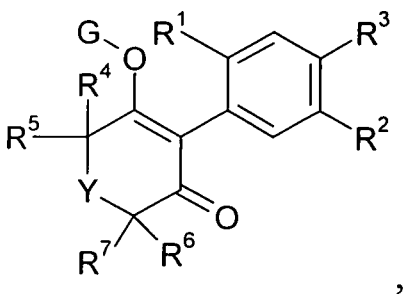
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為氯，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 82：

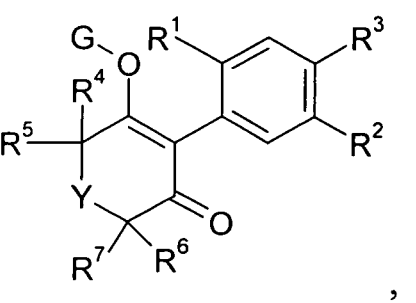
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為甲基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 83：

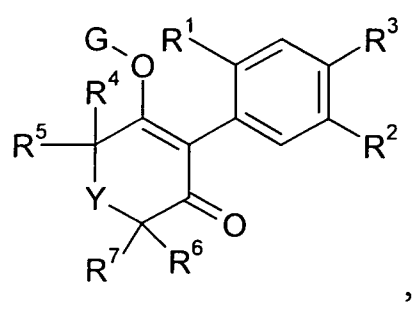
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 84：

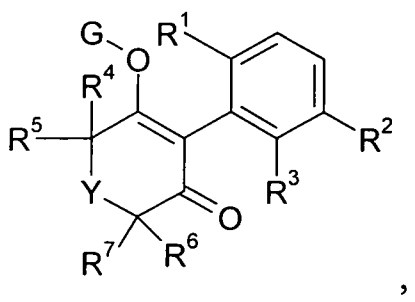
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為氫，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 85：

該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為甲基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如下所定義。

化合物編號	R ²	R ³
85.001	苯基	CH ₃
85.002	2-氟苯基	CH ₃
85.003	3-氟苯基	CH ₃
85.004	4-氟苯基	CH ₃
85.005	2-氯苯基	CH ₃
85.006	3-氯苯基	CH ₃
85.007	4-氯苯基	CH ₃
85.008	2-溴苯基	CH ₃
85.009	3-溴苯基	CH ₃
85.010	4-溴苯基	CH ₃
85.011	4-第三丁基	CH ₃
85.012	2-碘苯基	CH ₃
85.013	3-碘苯基	CH ₃
85.014	4-碘苯基	CH ₃
85.015	2-甲苯基	CH ₃
85.016	3-甲苯基	CH ₃
85.017	4-甲苯基	CH ₃
85.018	2-氰苯基	CH ₃
85.019	3-氰苯基	CH ₃
85.020	4-氰苯基	CH ₃
85.021	2-甲氧基苯基	CH ₃
85.022	3-甲氧基苯基	CH ₃

85.023	4-甲氧基苯基	CH ₃
85.024	2-二氟甲氧基苯基	CH ₃
85.025	3-二氟甲氧基苯基	CH ₃
85.026	4-二氟甲氧基苯基	CH ₃
85.027	2-二氟甲基苯基	CH ₃
85.028	3-二氟甲基苯基	CH ₃
85.029	4-二氟甲基苯基	CH ₃
85.030	2-三氟甲基苯基	CH ₃
85.031	3-三氟甲基苯基	CH ₃
85.032	4-三氟甲基苯基	CH ₃
85.033	2-三氟甲氧基苯基	CH ₃
85.034	3-三氟甲氧基苯基	CH ₃
85.035	4-三氟甲氧基苯基	CH ₃
85.036	4-甲硫基苯基	CH ₃
85.037	4-甲基亞磺醯基苯基	CH ₃
85.038	4-甲基磺醯基苯基	CH ₃
85.039	4-三氟甲硫基苯基	CH ₃
85.040	4-三氟甲基亞磺醯基苯基	CH ₃
85.041	4-三氟甲基磺醯基苯基	CH ₃
85.042	2,3-二氟苯基	CH ₃
85.043	2,4-二氟苯基	CH ₃
85.044	2,5-二氟苯基	CH ₃
85.045	2,6-二氟苯基	CH ₃
85.046	3,4-二氟苯基	CH ₃

85.047	3,5-二氯苯基	CH ₃
85.048	2,3-二氯苯基	CH ₃
85.049	2,4-二氯苯基	CH ₃
85.050	2,5-二氯苯基	CH ₃
85.051	2,6-二氯苯基	CH ₃
85.052	3,4-二氯苯基	CH ₃
85.053	3,4-二氯苯基	CH ₃
85.054	4-氯基-2-氟苯基	CH ₃
85.055	4-氯基-3-氟苯基	CH ₃
85.056	4-氯基-2-氟苯基	CH ₃
85.057	4-氯基-3-氟苯基	CH ₃
85.058	4-氯基-2-甲氧基苯基	CH ₃
85.059	4-氯基-3-甲氧基苯基	CH ₃
85.060	4-氯基-2-甲基苯基	CH ₃
85.061	4-氯基-3-甲基苯基	CH ₃
85.062	4-氯基-2-二氟甲氧基苯基	CH ₃
85.063	4-氯基-3-二氟甲氧基苯基	CH ₃
85.064	4-氯基-2-三氟甲氧基苯基	CH ₃
85.065	4-氯基-3-三氟甲氧基苯基	CH ₃
85.066	4-氯基-2-二氟甲基苯基	CH ₃
85.067	4-氯基-3-二氟甲基苯基	CH ₃
85.068	4-氯基-2-三氟甲基苯基	CH ₃
85.069	4-氯基-3-三氟甲基苯基	CH ₃
85.070	4-氯基-2,3-二氟苯基	CH ₃

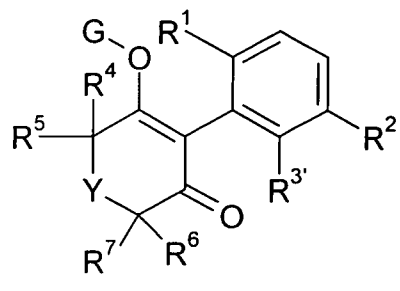
85.071	4-氯基-2,5-二氟苯基	CH ₃
85.072	4-氯基-2,6-二氟苯基	CH ₃
85.073	2,4-二氯基-3-氟苯基	CH ₃
85.074	2,4-二氯基-5-氟苯基	CH ₃
85.075	2,4-二氯基-6-氟苯基	CH ₃
85.076	2,3,4-三氯苯基	CH ₃
85.077	2,3,5-三氯苯基	CH ₃
85.078	2,3,6-三氯苯基	CH ₃
85.079	2,4,5-三氯苯基	CH ₃
85.080	2,4,6-三氯苯基	CH ₃
85.081	2,3,4-三氟苯基	CH ₃
85.082	2,3,5-三氟苯基	CH ₃
85.083	2,3,6-三氟苯基	CH ₃
85.084	2,4,5-三氟苯基	CH ₃
85.085	2,4,6-三氟苯基	CH ₃
85.086	2-氟基-4-三氟甲苯基	CH ₃
85.087	3-氟基-4-三氟甲苯基	CH ₃
85.088	2-氯基吡啶-5-基	CH ₃
85.089	3-氯基吡啶-5-基	CH ₃
85.090	2-甲基吡啶-5-基	CH ₃
85.091	3-甲基吡啶-5-基	CH ₃
85.092	2-三氟甲基吡啶-5-基	CH ₃
85.093	3-三氟甲基吡啶-5-基	CH ₃
85.094	2-氯基-3-甲基吡啶-5-基	CH ₃

85.095	2-氯基-4-甲基吡啶-5-基	CH ₃
85.096	6-氯基-2-甲基吡啶-3-基	CH ₃
85.097	2,3-二氯基吡啶-5-基	CH ₃
85.098	2,4-二氯基吡啶-5-基	CH ₃
85.099	2,6-二氯基吡啶-3-基	CH ₃
85.100	吡啶-2-基	CH ₃
85.101	2-氯基吡啶-5-基	CH ₃
85.102	2-溴基吡啶-5-基	CH ₃
85.103	嗒啶-3-基	CH ₃
85.104	6-溴基嗒啶-3-基	CH ₃
85.105	6-氯基嗒啶-3-基	CH ₃
85.106	嘧啶-5-基	CH ₃
85.107	2-溴基嘧啶-5-基	CH ₃
85.108	5-溴基嘧啶-2-基	CH ₃
85.109	2-氯基嘧啶-5-基	CH ₃
85.110	5-氯基嘧啶-2-基	CH ₃
85.111	2-呋喃基	CH ₃
85.112	3-呋喃基	CH ₃
85.113	2-噻吩基	CH ₃
85.114	3-噻吩基	CH ₃
85.115	4-溴基噻吩-2-基	CH ₃
85.116	5-溴基噻吩-2-基	CH ₃
85.117	4-氯基噻吩-2-基	CH ₃
85.118	5-氯基噻吩-2-基	CH ₃

85.119	吡唑-1-基	CH ₃
85.120	3-氯基吡唑-1-基	CH ₃
85.121	4-氯基吡唑-1-基	CH ₃
85.122	1-甲基吡唑-4-基	CH ₃
85.123	1-甲基-3-三氟甲基吡唑-5-基	CH ₃
85.124	2-噻唑基	CH ₃
85.125	4-甲基噻唑-2-基	CH ₃
85.126	5-甲基噻唑-2-基	CH ₃

表 86 :

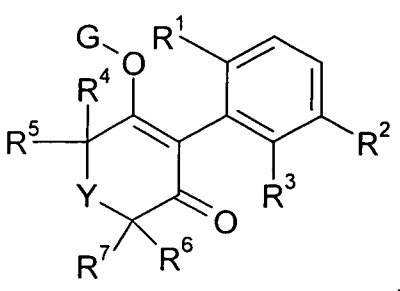
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 87 :

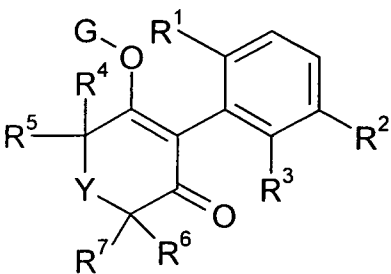
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為甲基，R⁴ 為甲基，R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 88：

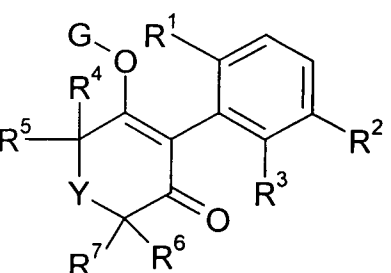
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為乙基，R⁴ 為甲基，R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 89：

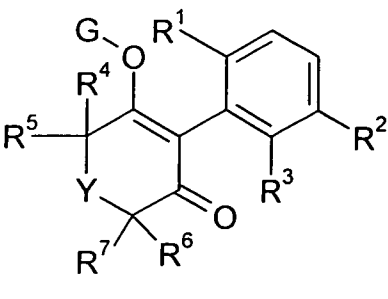
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為甲基，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 90：

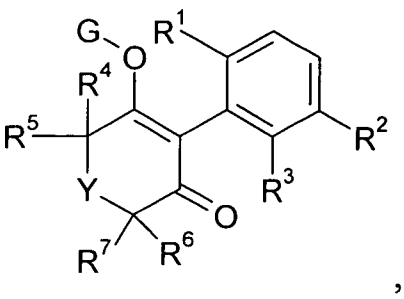
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為乙基，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，
G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 91：

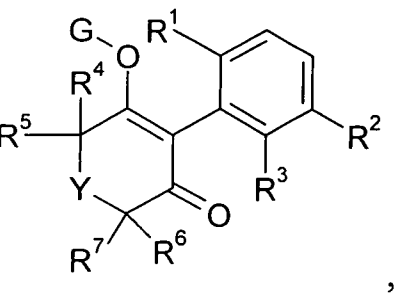
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為甲基，R⁴ 及 R⁶ 為甲基，R⁵ 及 R⁷ 為氫，
G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 92：

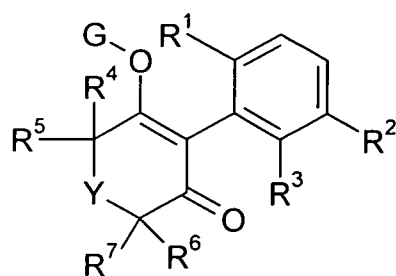
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為乙基， R^4 及 R^6 為甲基， R^5 及 R^7 為氫，
G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 93：

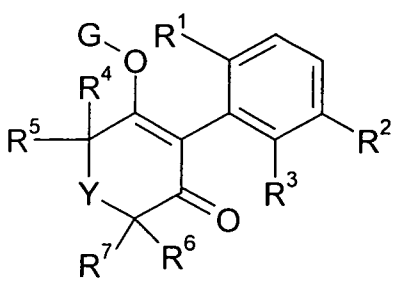
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 為甲基， R^7 為氫，G
為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 94：

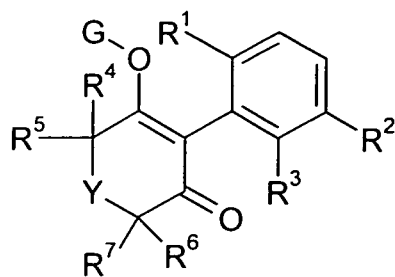
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為乙基， R^4 、 R^5 及 R^6 為甲基， R^7 為氫，
G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 95：

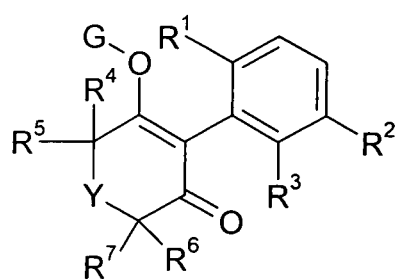
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 96：

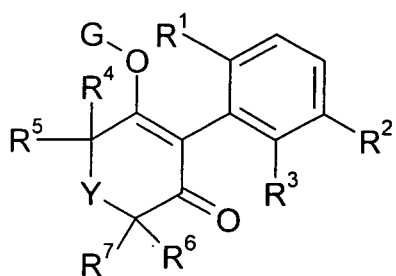
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為乙基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 97：

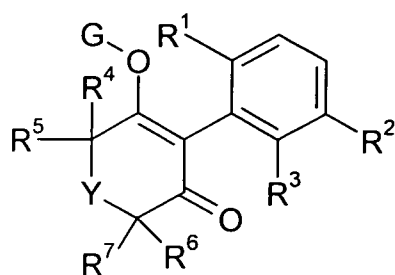
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為甲基， R^4 、 R^5 及 R^6 為甲基， R^7 為甲氧基甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 98：

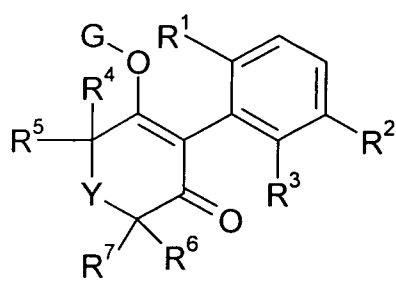
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為乙基， R^4 、 R^5 及 R^6 為甲基， R^7 為甲氧基甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 99：

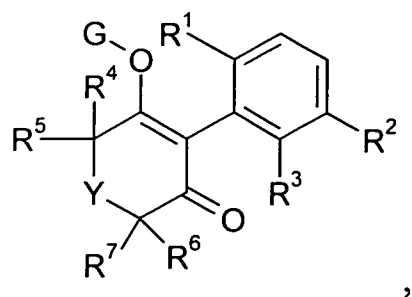
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 100：

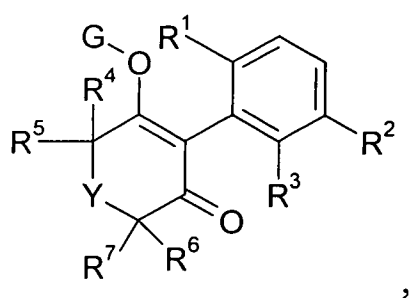
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為乙基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 82 中所定義。

表 101：

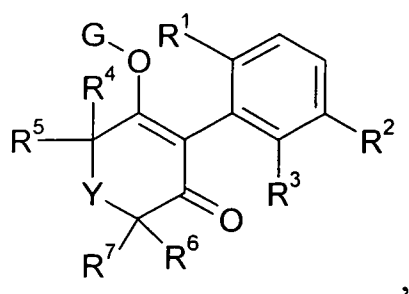
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為甲基， R^4 為甲基， R^5 、 R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 102：

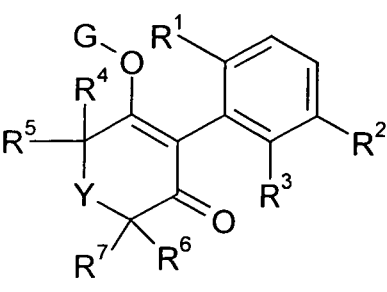
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為乙基，R⁴ 為甲基，R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 103：

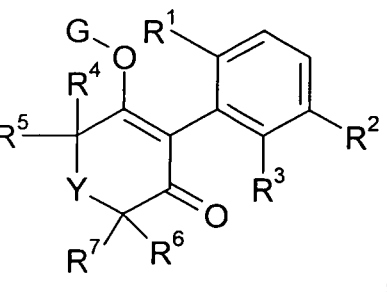
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為甲基，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 104：

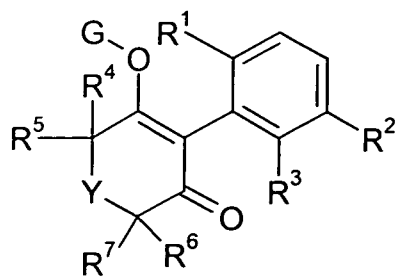
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為乙基，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 105：

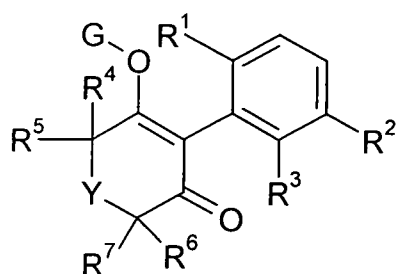
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為甲基， R^4 及 R^6 為甲基， R^5 及 R^7 為氫，
G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 106：

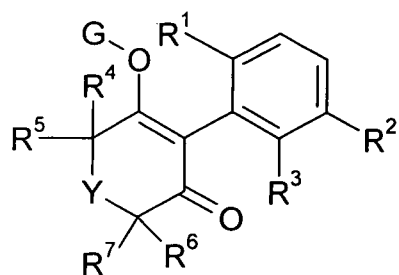
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為乙基， R^4 及 R^6 為甲基， R^5 及 R^7 為氫，
G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 107：

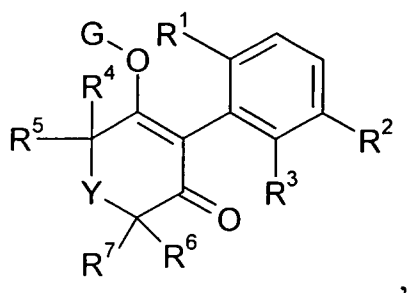
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為甲基， R^4 、 R^5 及 R^6 為甲基， R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 108：

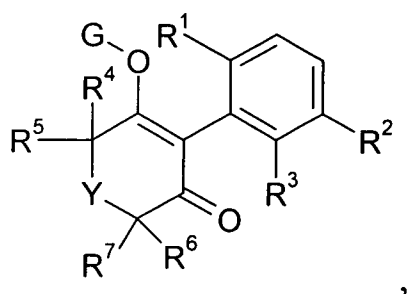
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為乙基， R^4 、 R^5 及 R^6 為甲基， R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 109：

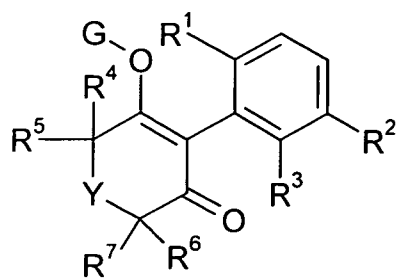
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 110：

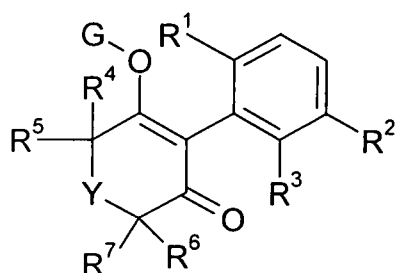
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 111：

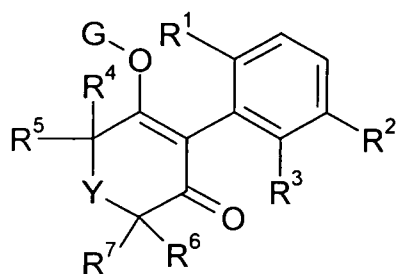
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為甲基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 112：

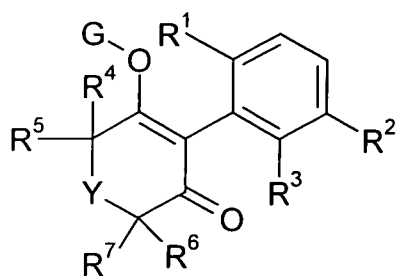
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 113：

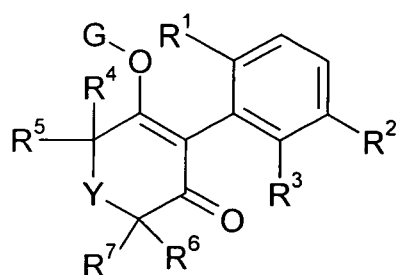
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為甲基，R⁴ 為甲基，R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 114：

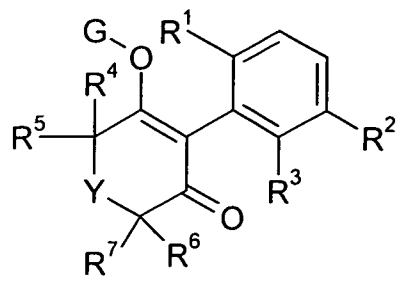
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁴ 為甲基，R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 115：

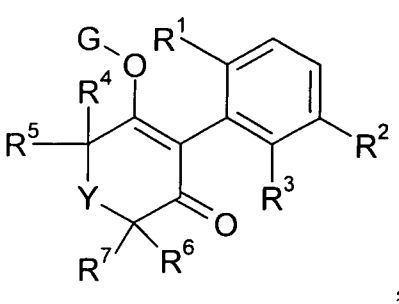
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為甲基，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，
G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 116：

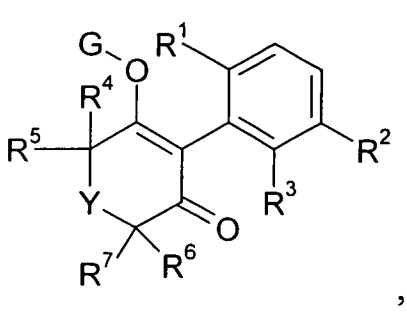
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，
G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 117：

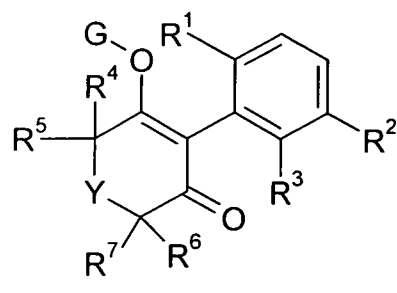
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O, R^1 為甲基, R^4 及 R^6 為甲基, R^5 及 R^7 為氫, G 為氫, 而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 118 :

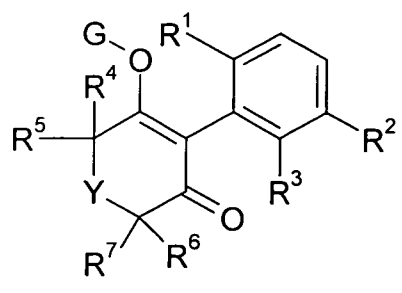
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O, R^1 為乙基, R^4 及 R^6 為甲基, R^5 及 R^7 為氫, G 為氫, 而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 119 :

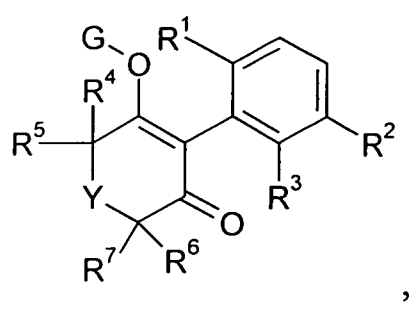
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O, R^1 為甲基, R^4 、 R^5 及 R^6 為甲基, R^7 為氫, G 為氫, 而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 120 :

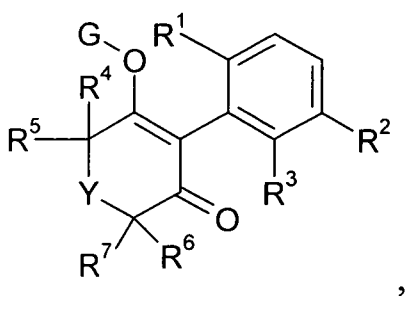
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 121：

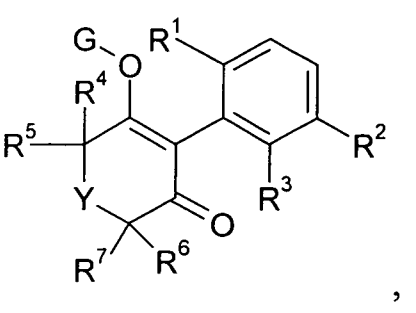
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為甲基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 122：

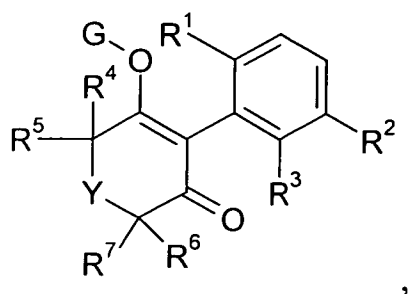
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 123：

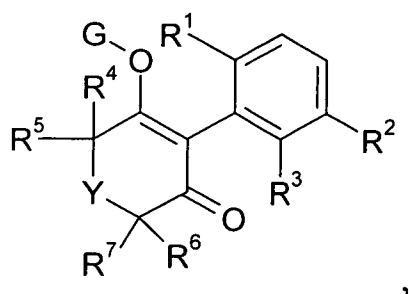
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S(=O)₂，R¹ 為甲基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 124：

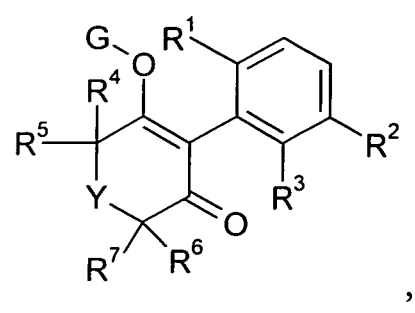
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S(=O)₂，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 125：

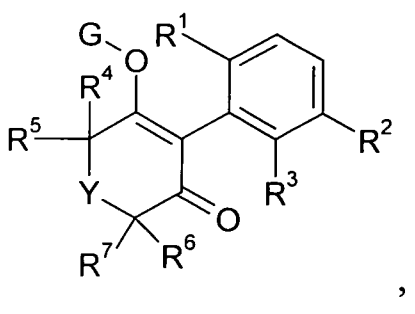
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為甲基， R^4 為甲基， R^5 、 R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 126：

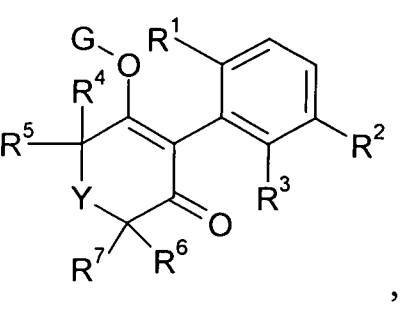
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^4 為甲基， R^5 、 R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 127：

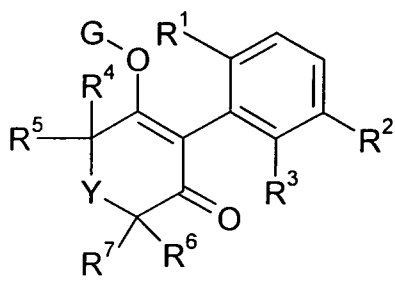
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為甲基， R^4 及 R^5 為甲基， R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 128：

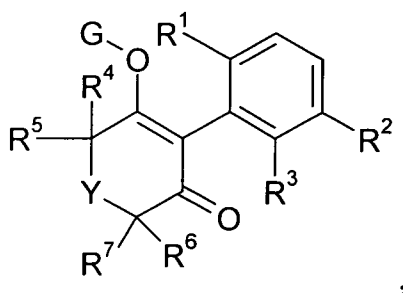
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^4 及 R^5 為甲基， R^6 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 129：

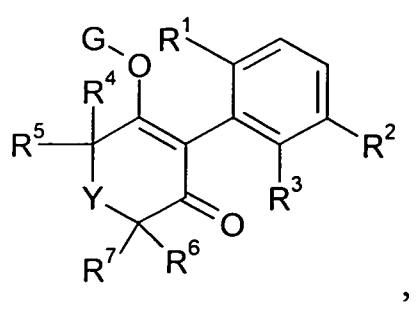
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為甲基， R^4 及 R^6 為甲基， R^5 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 130：

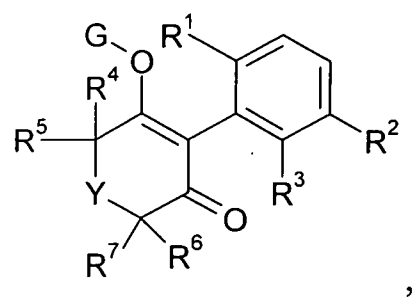
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^4 及 R^6 為甲基， R^5 及 R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 131：

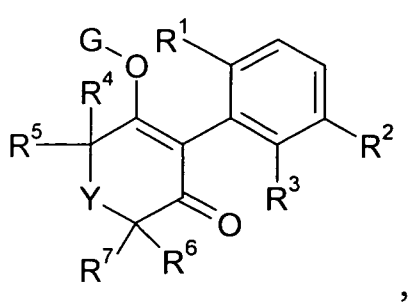
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為甲基， R^4 、 R^5 及 R^6 為甲基， R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 132：

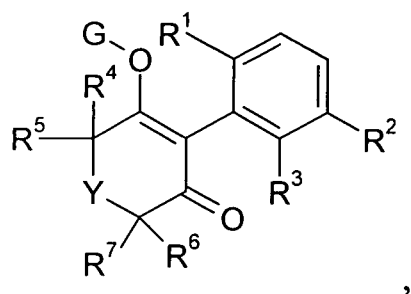
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^4 、 R^5 及 R^6 為甲基， R^7 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 133：

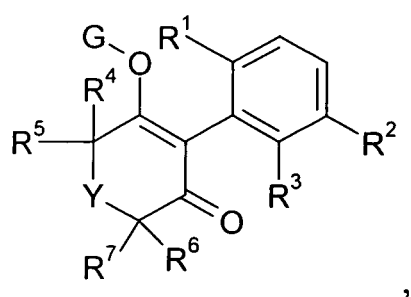
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 134：

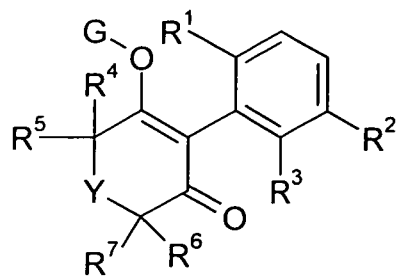
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 135：

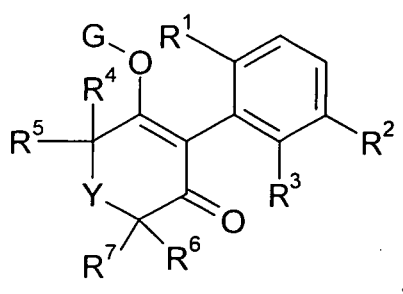
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為甲基，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 136：

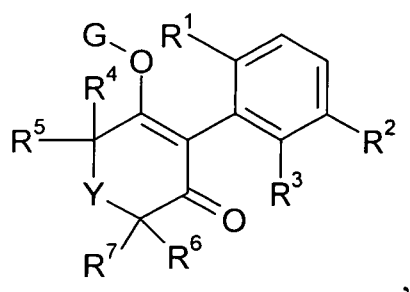
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基，R⁴ 及 R⁵ 為甲基，R⁶ 及 R⁷ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 137：

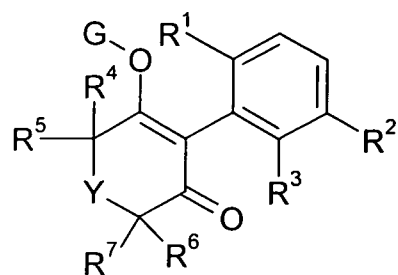
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為甲基，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R⁷ 為氫，
G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 138：

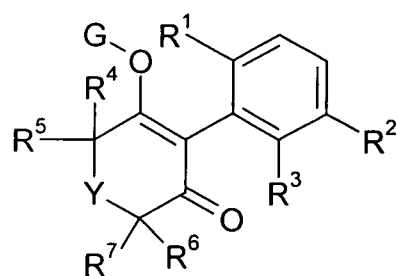
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R⁷ 為氫，
G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 139：

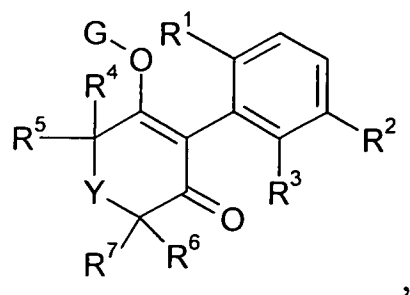
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為甲基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G
為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 140：

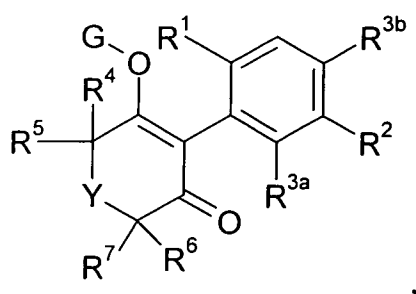
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 141：

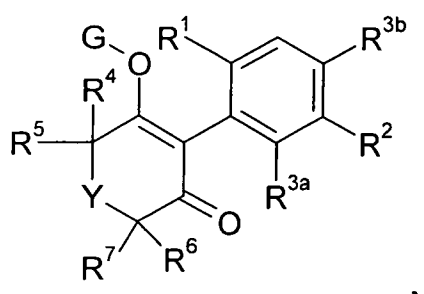
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，而 R¹ 及 R^{3a} 為甲基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 142：

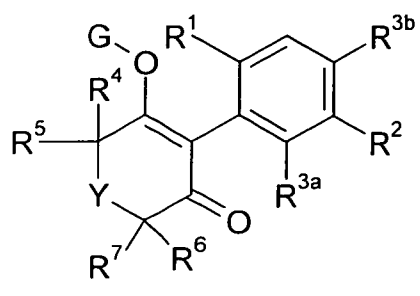
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，而 R^1 及 R^{3a} 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 143：

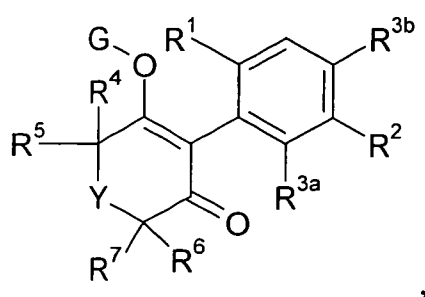
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，而 R^1 及 R^{3a} 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 144：

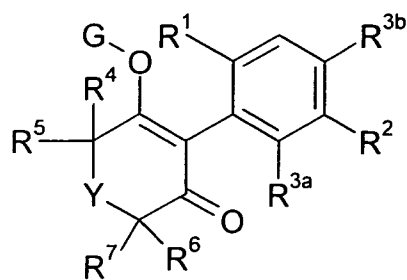
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S(=O)₂，而 R^1 及 R^{3a} 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 145：

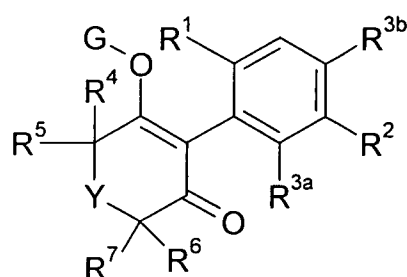
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，而 R^1 及 R^{3a} 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 146：

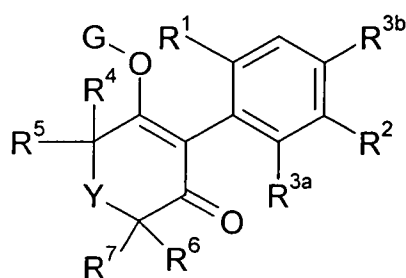
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，而 R^1 為乙基及 R^{3a} 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 147：

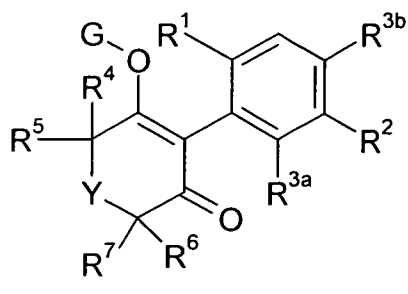
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，而 R^1 為乙基及 R^{3a} 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 148：

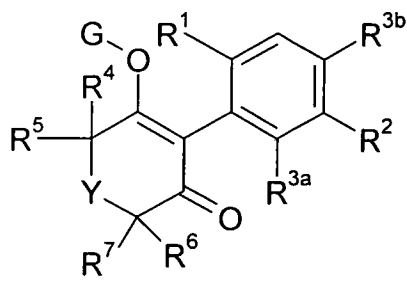
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，而 R^1 為乙基及 R^{3a} 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 149：

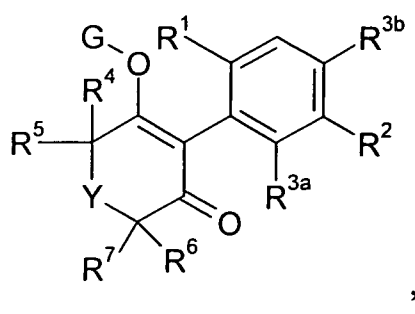
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ，而 R^1 為乙基及 R^{3a} 為甲基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 150：

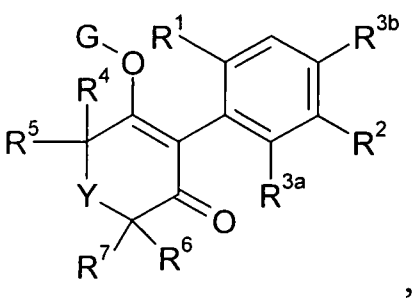
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，而 R¹ 為乙基及 R^{3a} 為甲基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 151：

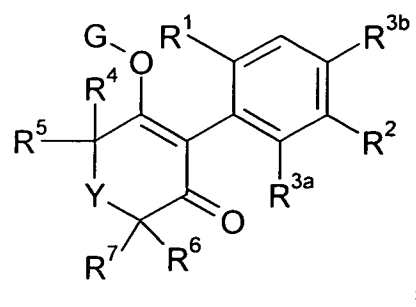
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，而 R¹ 及 R^{3a} 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 152：

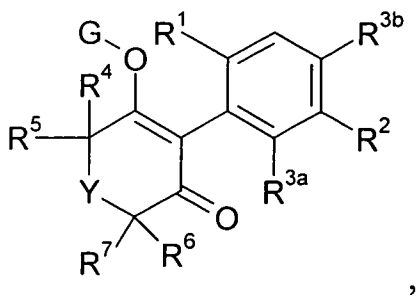
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，而 R¹ 及 R^{3a} 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 153：

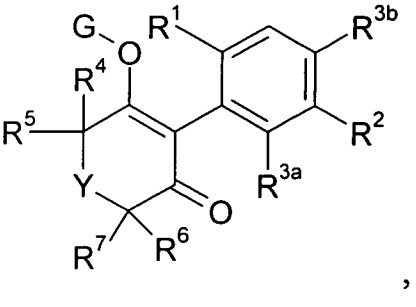
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，而 R¹ 及 R^{3a} 為乙基，R⁴、R⁵、R⁶ 及 R⁷ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 154：

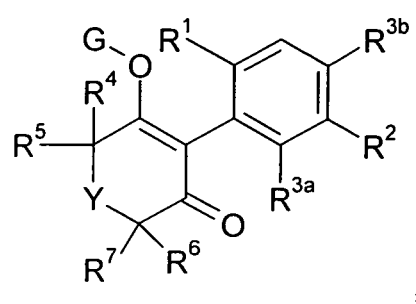
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ，而 R^1 及 R^{3a} 為乙基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 155：

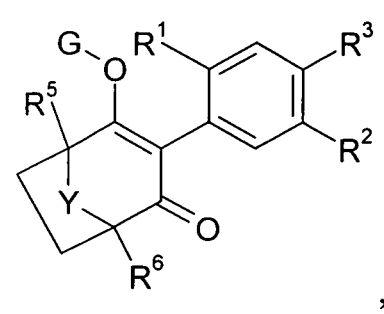
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $C=O$ ，而 R^1 及 R^{3a} 為乙基， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 156：

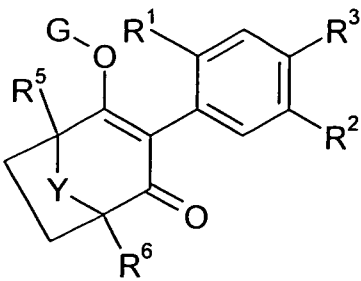
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為甲基， R^5 及 R^6 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 157：

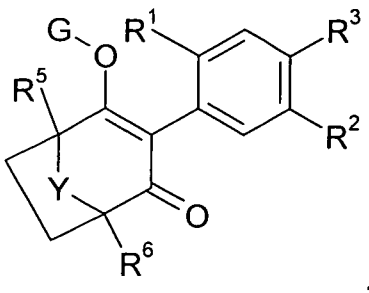
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 158：

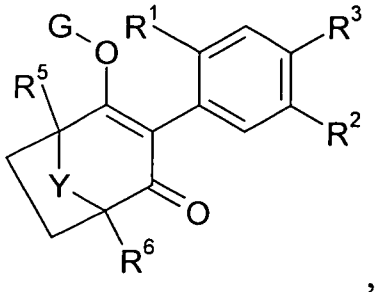
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為氯，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 159：

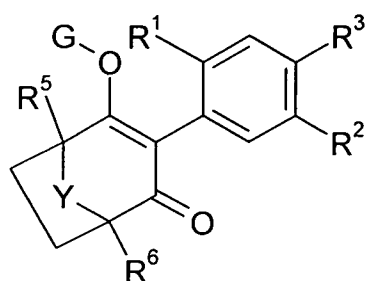
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為甲基， R^5 為氫及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 160：

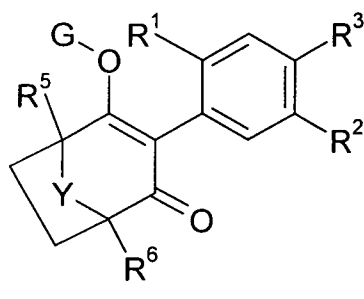
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為乙基， R^5 為氫及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 161：

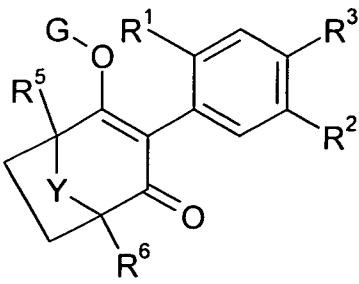
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為氯， R^5 為氫及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 162：

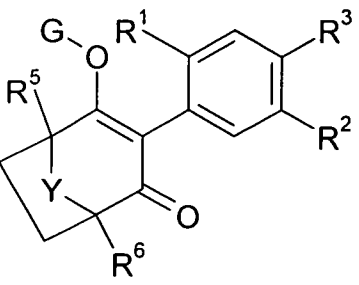
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 163：

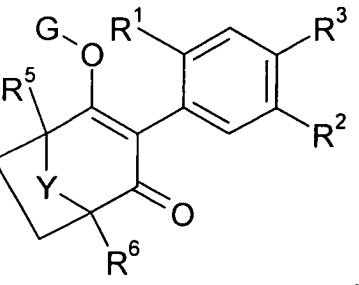
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 164：

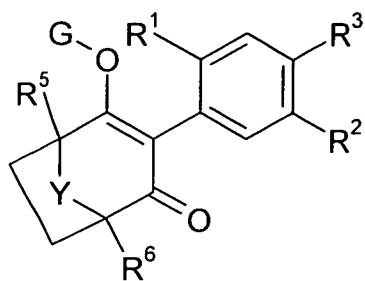
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為氯， R^5 及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 165：

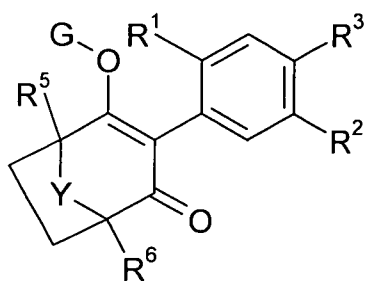
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為甲基， R^5 為氫及 R^6 為甲氧基甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 166：

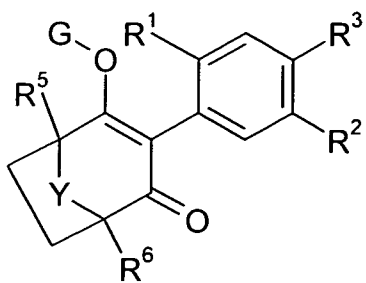
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為乙基， R^5 為氫及 R^6 為甲氧基甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 167：

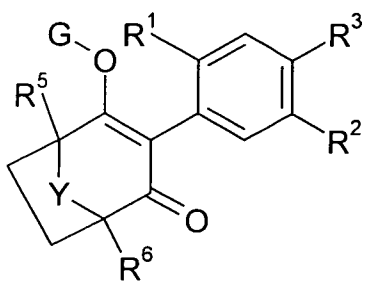
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為氯， R^5 為氫及 R^6 為甲氧基甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 168：

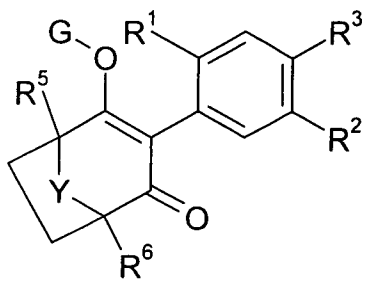
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為甲基， R^5 為氫及 R^6 為乙氧基甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 169：

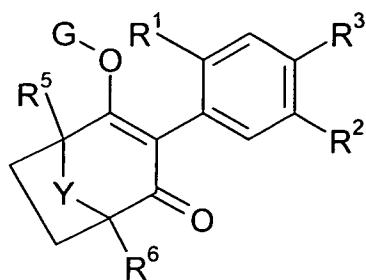
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為乙基， R^5 為氫及 R^6 為乙氧基甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 170：

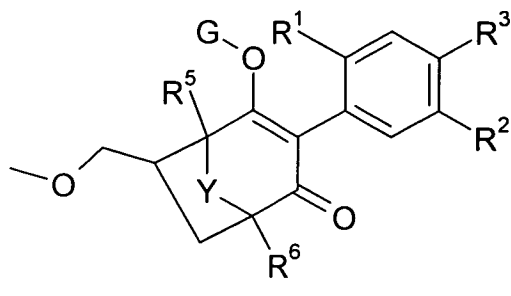
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為氫， R^5 為氫及 R^6 為乙氧基甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 171：

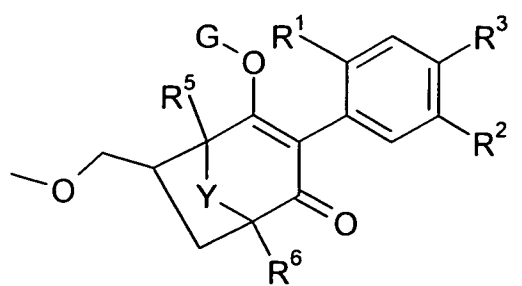
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為甲基， R^5 及 R^6 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 172：

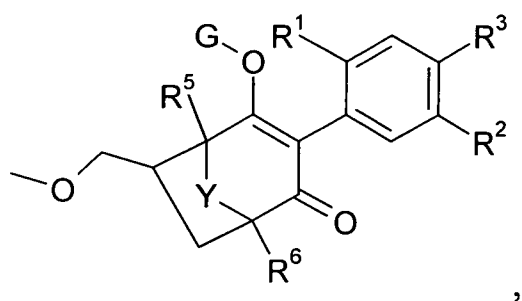
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為乙基， R^5 及 R^6 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 173：

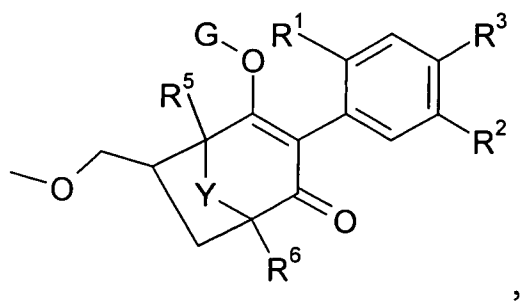
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為氯， R^5 及 R^6 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 174：

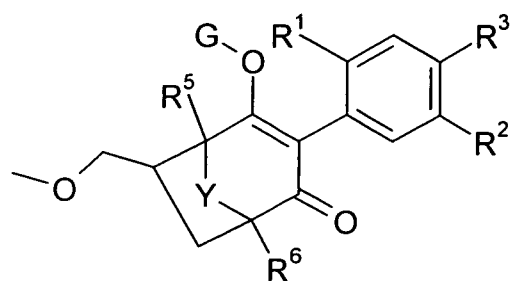
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為甲基， R^5 為甲基， R^6 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 175：

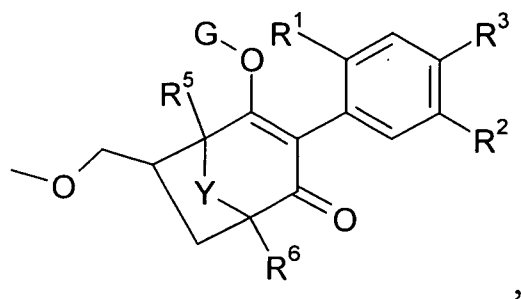
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為乙基， R^5 為甲基， R^6 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 176：

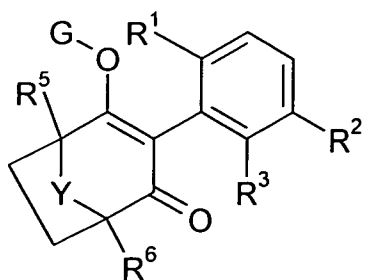
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為氯， R^5 為甲基， R^6 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 177：

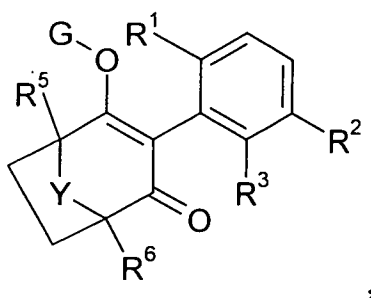
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為甲基， R^5 及 R^6 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 178：

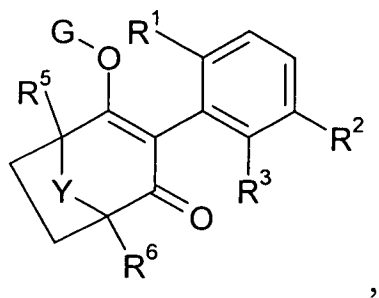
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為乙基， R^5 及 R^6 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 179：

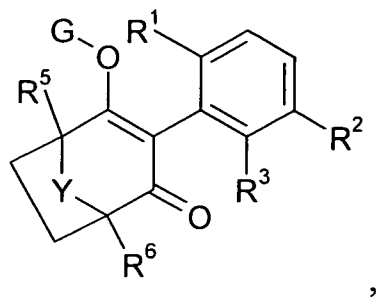
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為甲基，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 180：

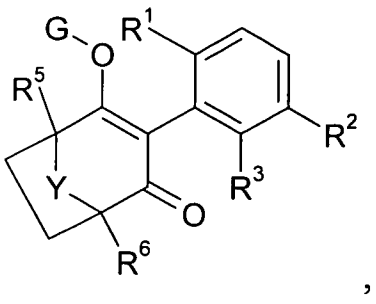
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為乙基，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 181：

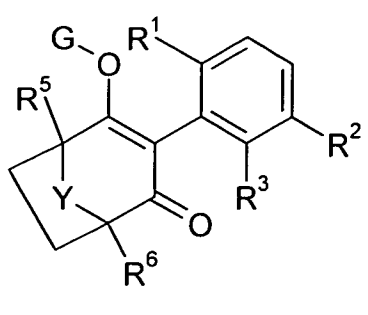
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 182：

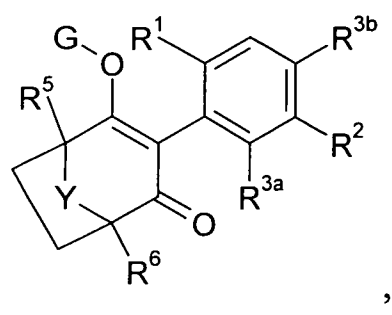
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 183：

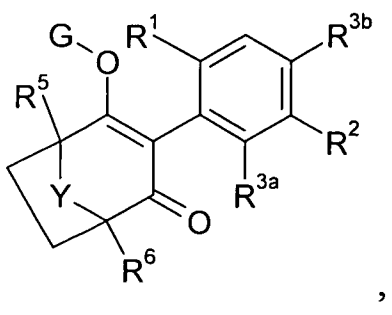
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 及 R^{3a} 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 184：

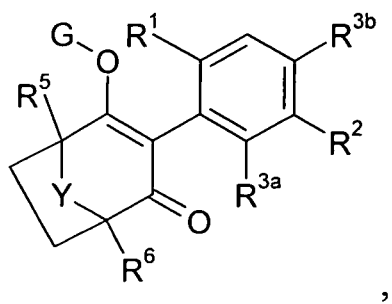
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為乙基及 R^{3a} 為甲基， R^5 及 R^6 為氫， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 185：

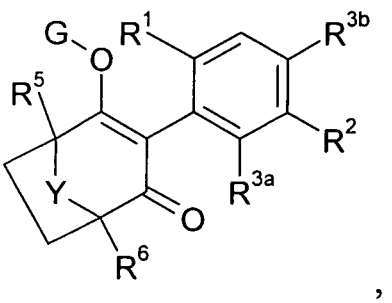
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 及 R^{3a} 為乙基， R^5 及 R^6 為氫， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 186：

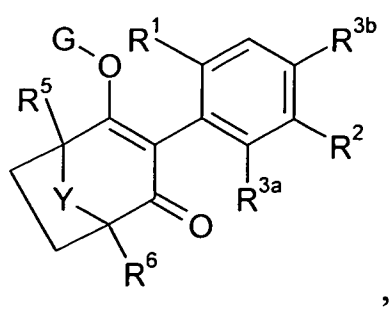
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 及 R^{3a} 為甲基， R^5 為氫及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 187：

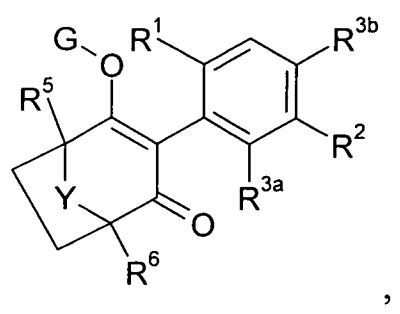
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 為乙基及 R^{3a} 為甲基，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 188：

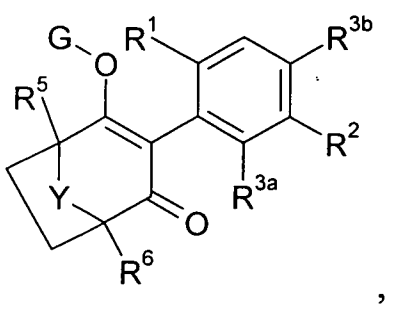
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O，R¹ 及 R^{3a} 為乙基，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 189：

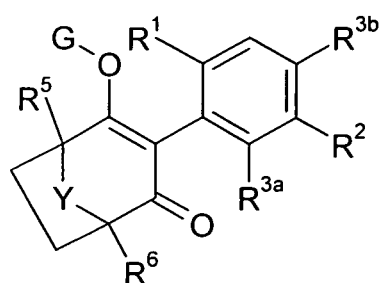
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 及 R^{3a} 為甲基， R^5 及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 190：

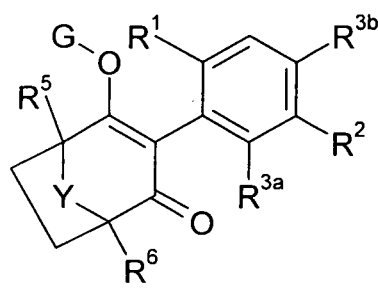
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 為乙基及 R^{3a} 為甲基， R^5 及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 191：

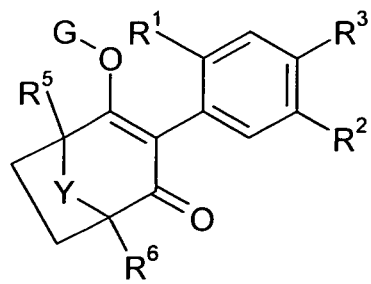
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 O， R^1 及 R^{3a} 為乙基， R^5 及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 192：

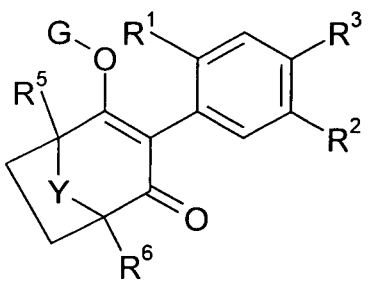
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 193：

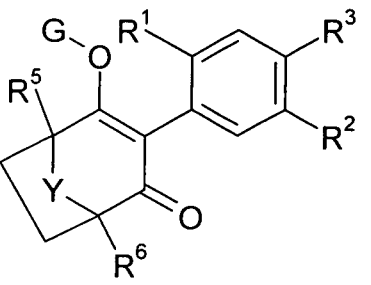
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 194：

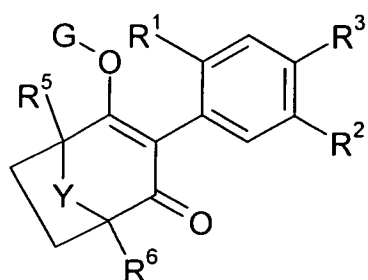
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為氯， R^5 及 R^6 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 195：

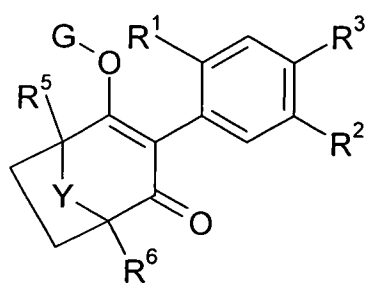
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為甲基， R^5 為氫及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 196：

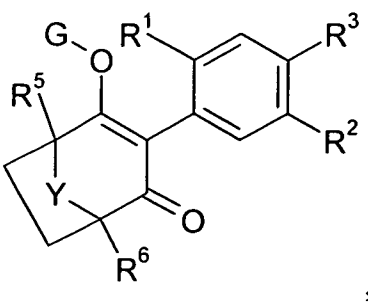
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為乙基， R^5 為氫及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 197：

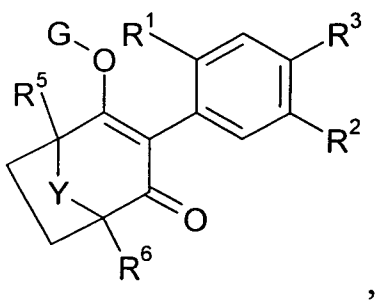
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為氯，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 198：

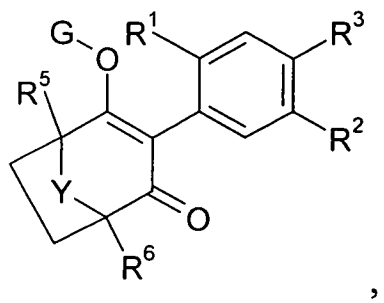
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 199：

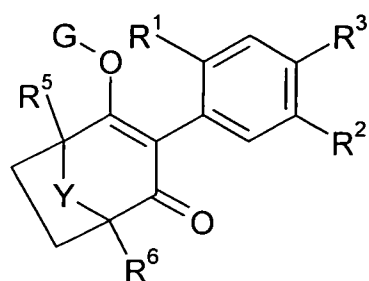
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為乙基， R^5 及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 200：

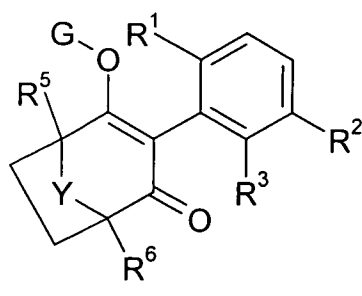
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為氯， R^5 及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 201：

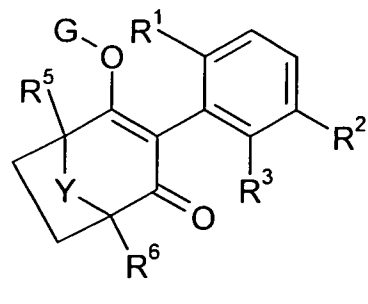
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為甲基， R^5 及 R^6 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 202：

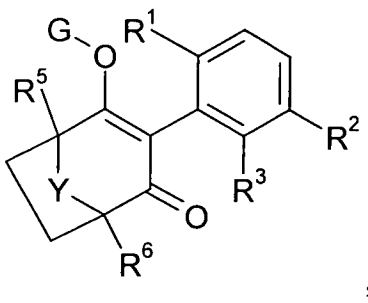
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 203：

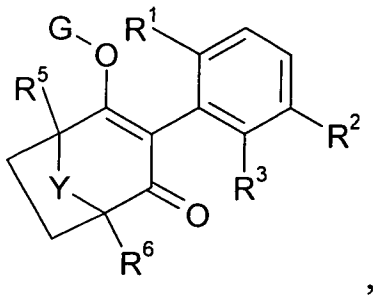
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為甲基，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 204：

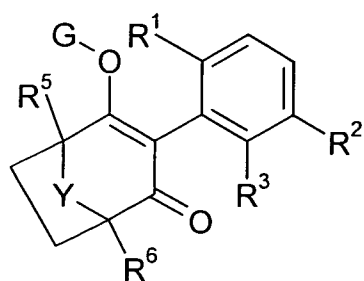
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為乙基， R^5 為氫及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 205：

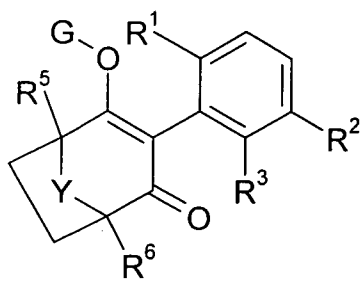
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為甲基， R^5 及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 206：

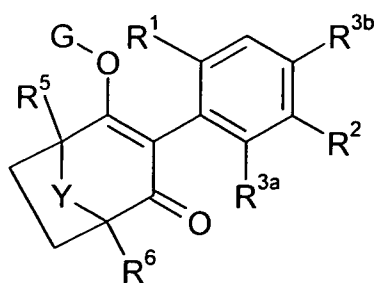
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為乙基， R^5 及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 207：

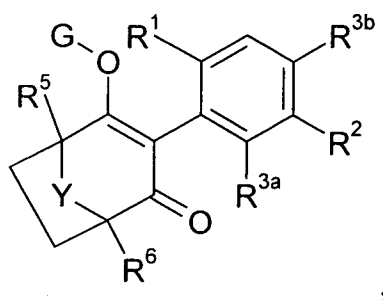
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 及 R^{3a} 為甲基， R^5 及 R^6 為氫， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 208：

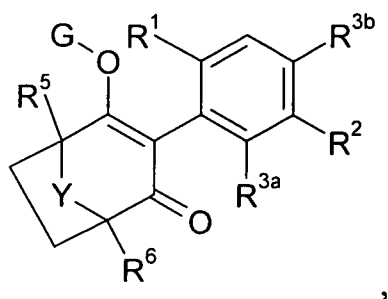
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為乙基及 R^{3a} 為甲基， R^5 及 R^6 為氫， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 209：

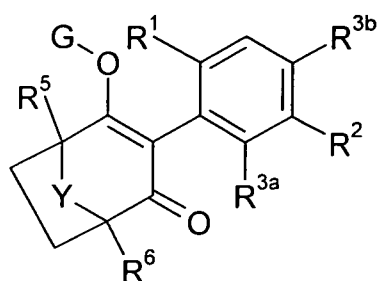
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 及 R^{3a} 為乙基， R^5 及 R^6 為氫， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 210：

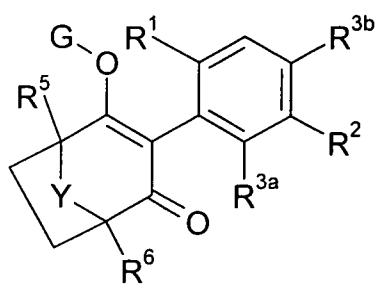
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 及 R^{3a} 為甲基， R^5 為氫及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 211：

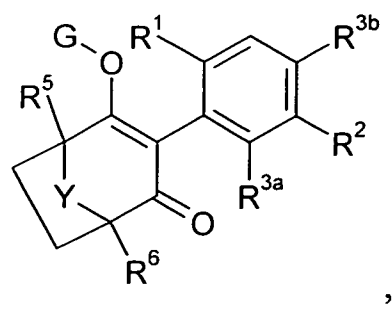
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S， R^1 為乙基及 R^{3a} 為甲基， R^5 為氫及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 212：

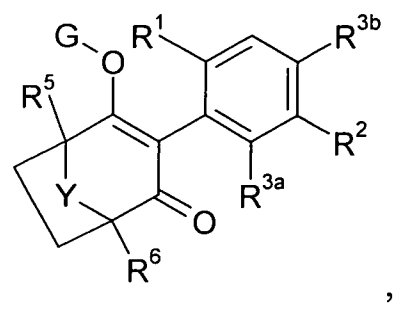
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 及 R^{3a} 為乙基，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 213：

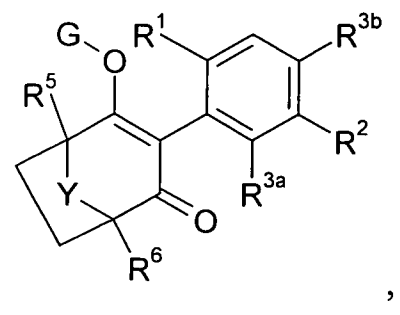
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 及 R^{3a} 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 214：

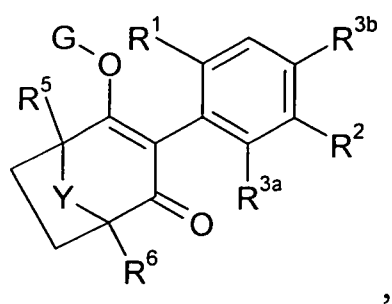
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 為乙基及 R^{3a} 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 215：

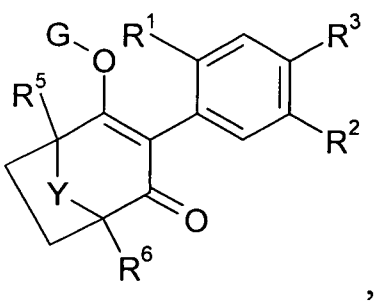
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S，R¹ 及 R^{3a} 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 216：

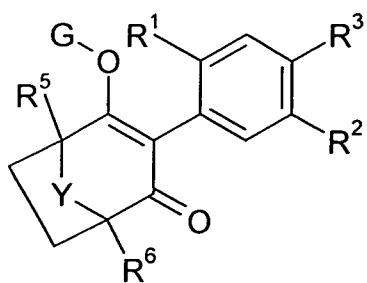
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 217：

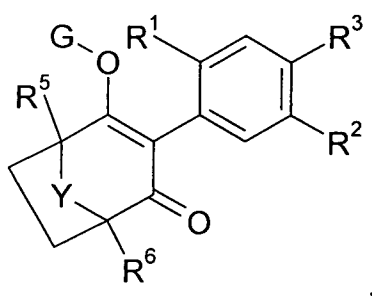
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 218：

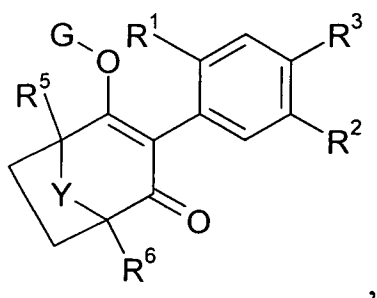
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為氫，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 219：

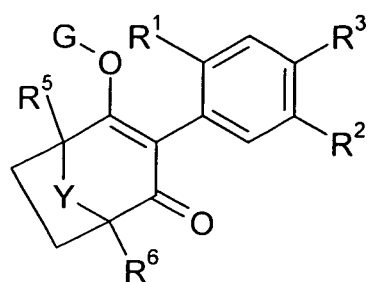
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為甲基，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 220：

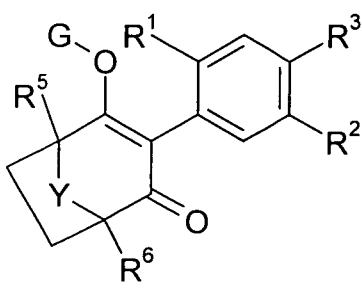
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 221：

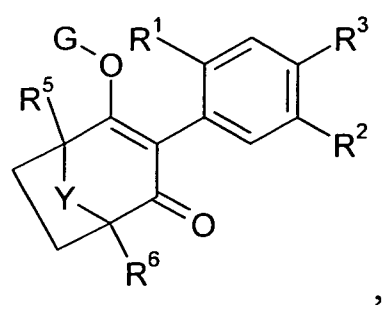
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為氯，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 222：

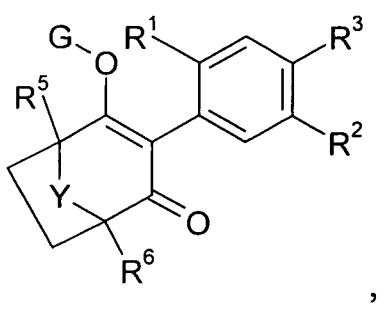
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 223：

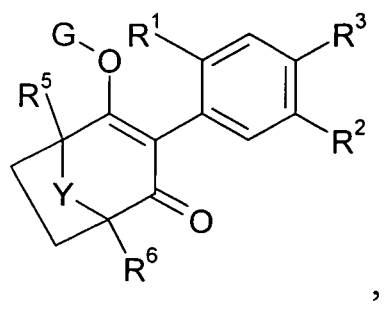
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 224：

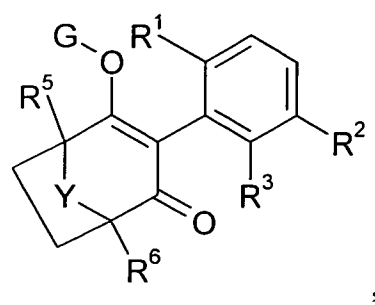
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為氯，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 225：

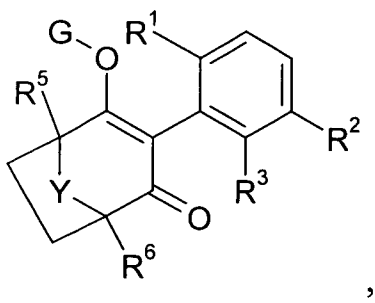
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 226：

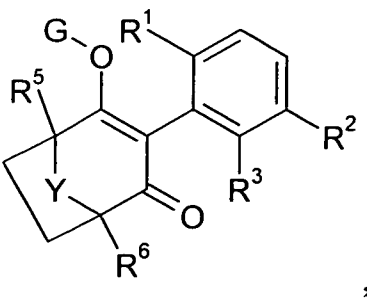
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 227：

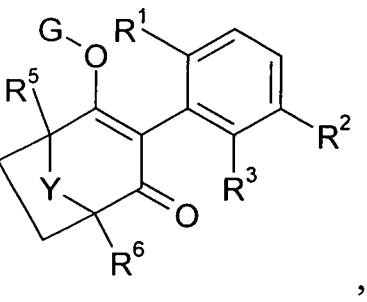
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為甲基，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 228：

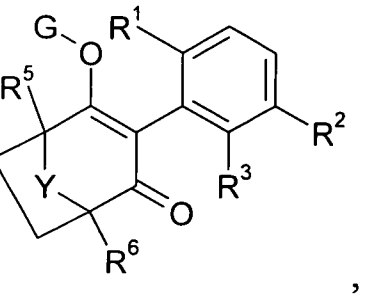
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 229：

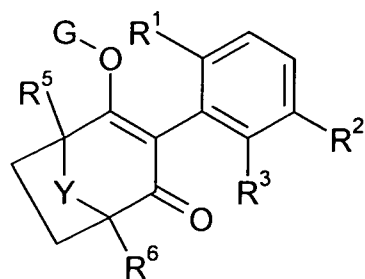
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 230：

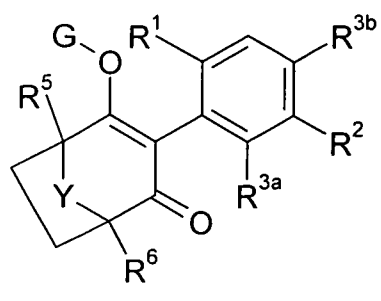
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 231：

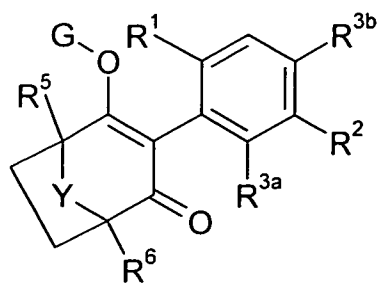
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 及 R^{3a} 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 232：

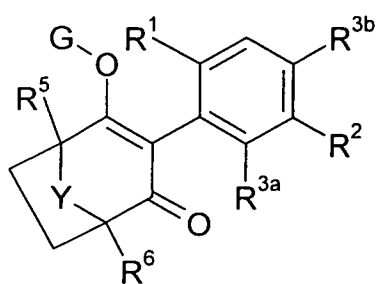
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O， R^1 為乙基及 R^{3a} 為甲基， R^5 及 R^6 為氫， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 233：

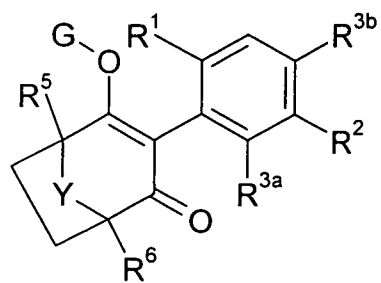
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O， R^1 及 R^{3a} 為乙基， R^5 及 R^6 為氫， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 234：

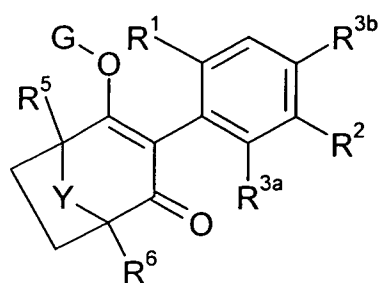
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O， R^1 及 R^{3a} 為甲基， R^5 為氫及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 235：

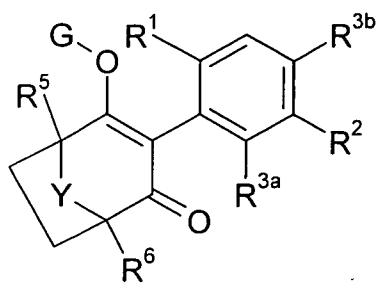
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O， R^1 為乙基及 R^{3a} 為甲基， R^5 為氫及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 236：

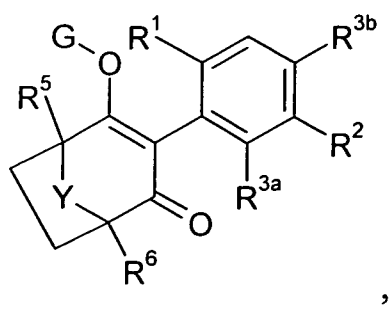
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O， R^1 及 R^{3a} 為乙基， R^5 為氫及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 237：

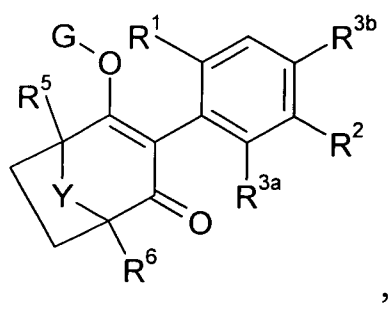
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 及 R^{3a} 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 238：

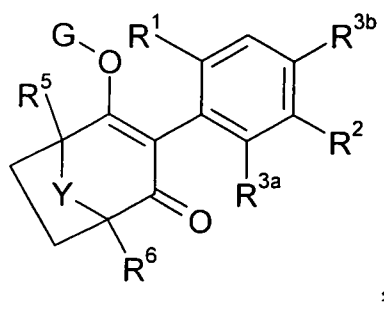
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 為乙基及 R^{3a} 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 239：

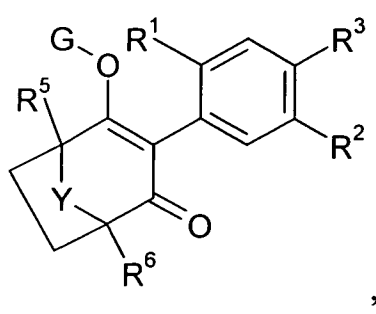
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S=O，R¹ 及 R^{3a} 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 240：

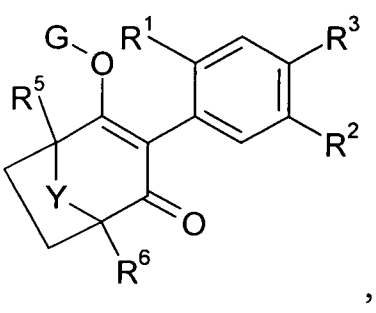
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S(=O)₂，R¹ 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 241：

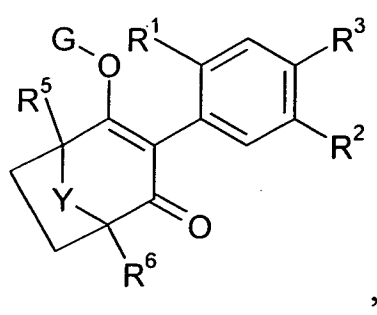
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 S(=O)₂，R¹ 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 242：

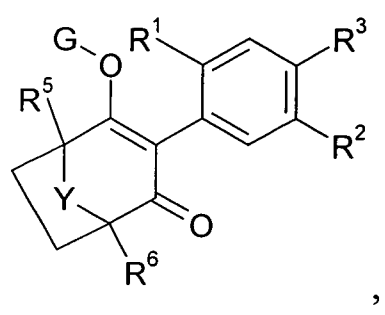
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為 氯， R^5 及 R^6 為 氫，G 為 氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 243：

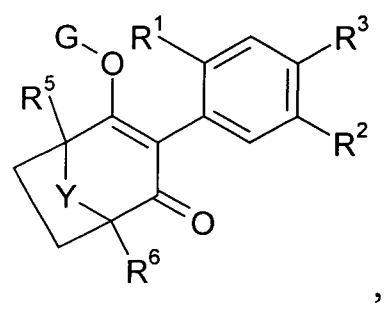
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為 甲基， R^5 為 氫及 R^6 為 甲基，G 為 氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 244：

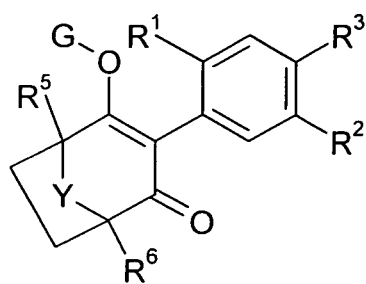
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^5 為氫及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 245：

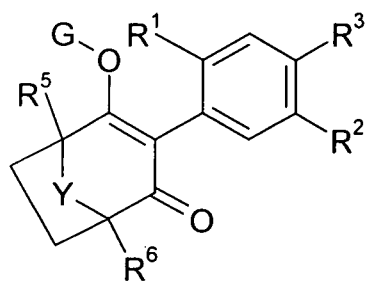
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為氯， R^5 為氫及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 246：

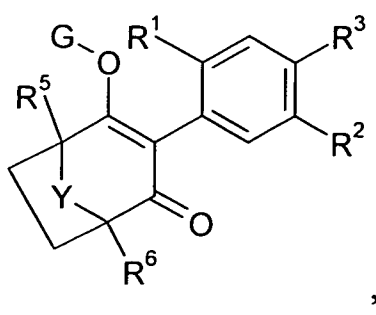
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為甲基， R^5 及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 247：

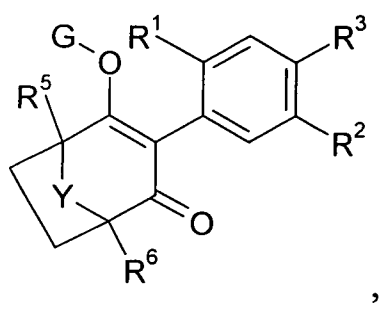
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^5 及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 248：

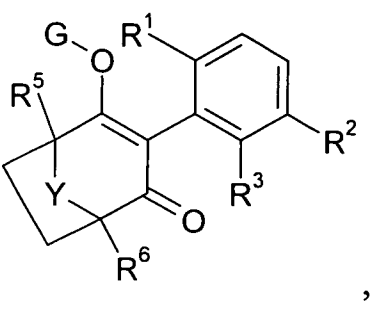
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為氯， R^5 及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 249：

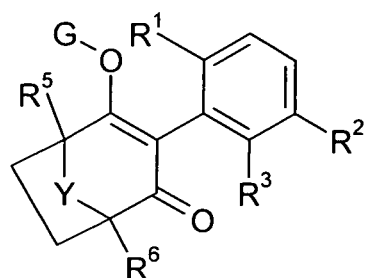
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為甲基， R^5 及 R^6 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 250：

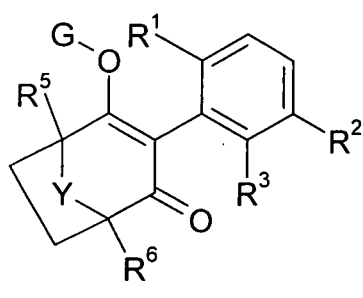
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^5 及 R^6 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 251：

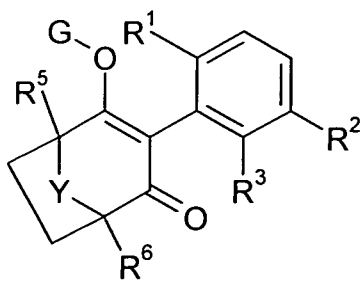
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為甲基， R^5 為氫及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 252：

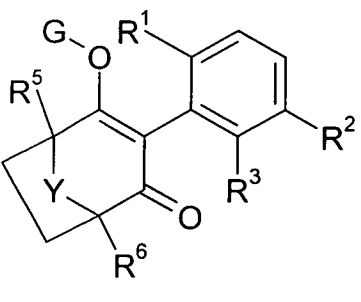
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^5 為氫及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 253：

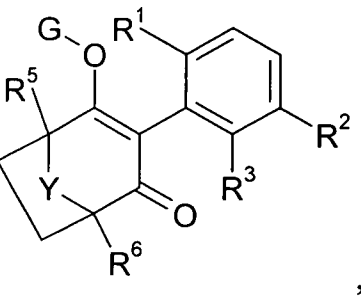
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為甲基， R^5 及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 254：

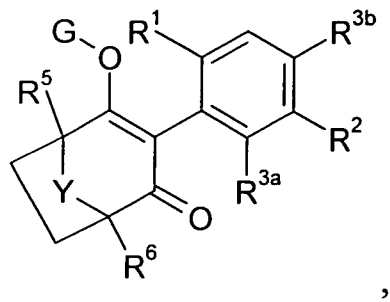
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基， R^5 及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 255：

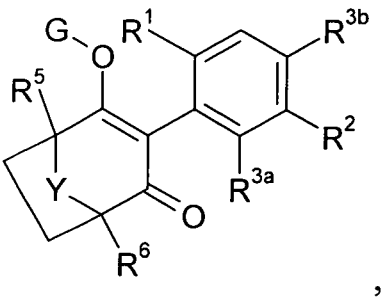
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 及 R^{3a} 為甲基， R^5 及 R^6 為氫， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 256：

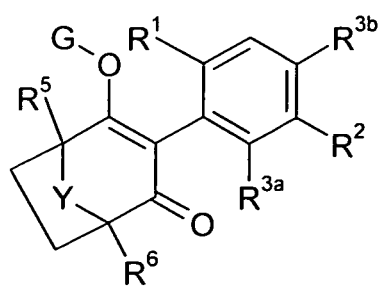
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基及 R^{3a} 為甲基， R^5 及 R^6 為氫， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 257：

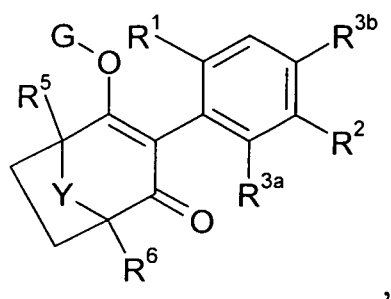
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 及 R^{3a} 為乙基， R^5 及 R^6 為氫， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 258：

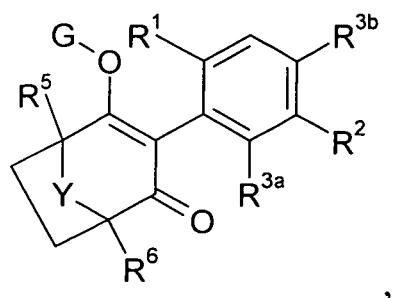
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 及 R^{3a} 為甲基， R^5 為氫及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 259：

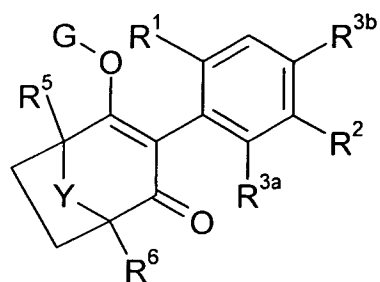
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基及 R^{3a} 為甲基， R^5 為氫及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 260：

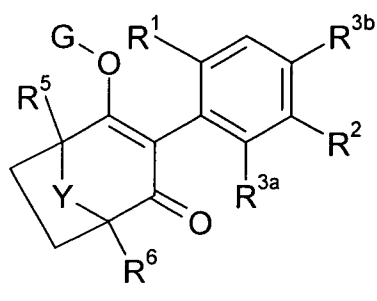
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 及 R^{3a} 為乙基， R^5 為氫及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 261：

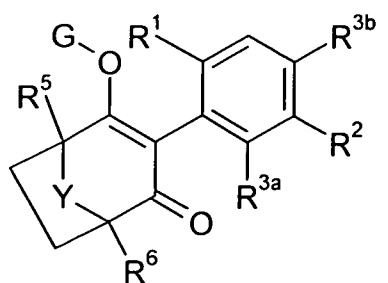
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 及 R^{3a} 為甲基， R^5 及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 262：

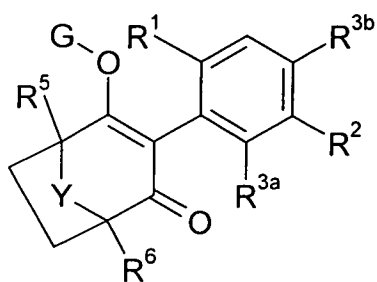
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 為乙基及 R^{3a} 為甲基， R^5 及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 263：

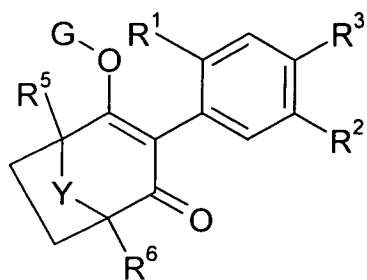
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 $S(=O)_2$ ， R^1 及 R^{3a} 為乙基， R^5 及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 264：

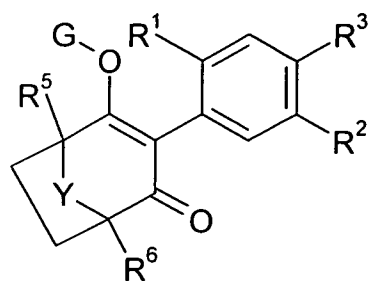
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 265：

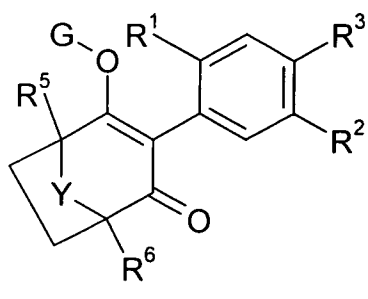
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 266：

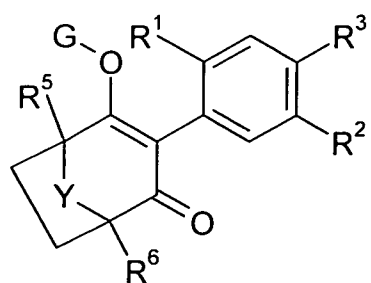
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為氯，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 267：

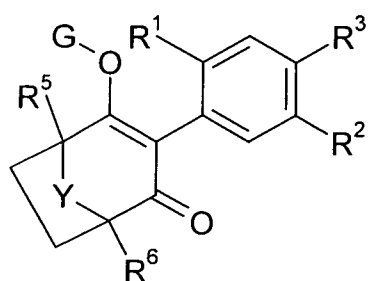
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為甲基，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 268：

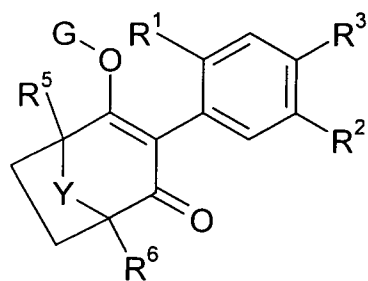
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 269：

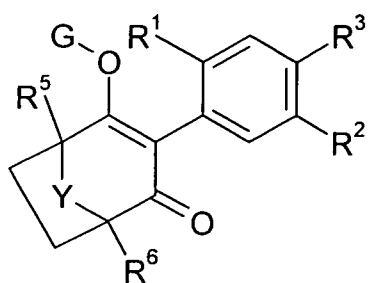
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為氯，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 270：

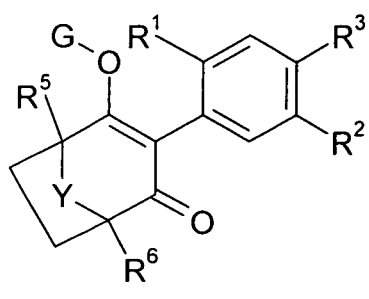
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 271：

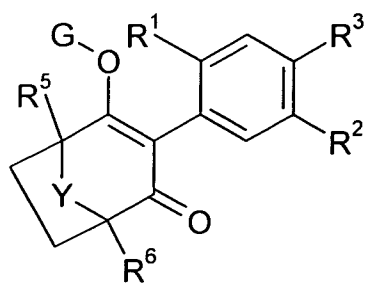
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 272：

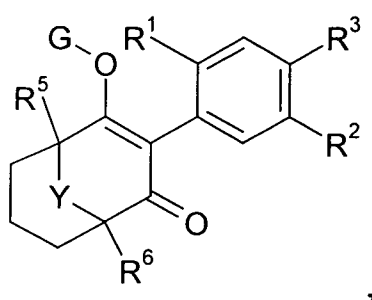
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O， R^1 為氯， R^5 及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 273：

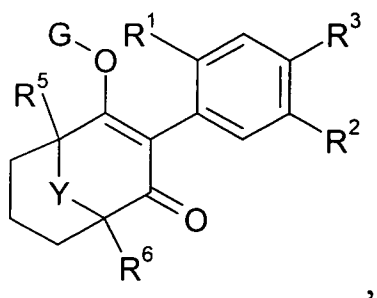
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O， R^1 為甲基， R^5 及 R^6 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 1 中所定義。

表 274：

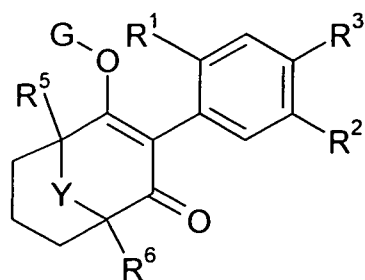
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 275：

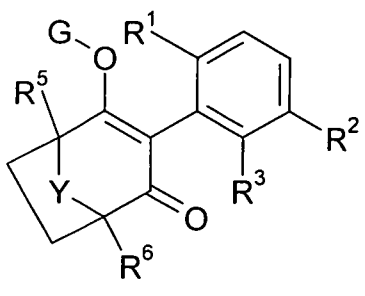
該表涵蓋 378 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為氯，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 1 中所定義。

表 276：

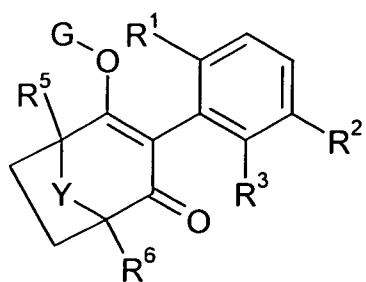
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 277：

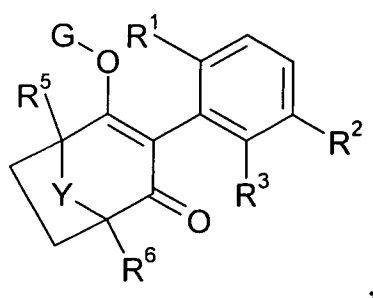
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O， R^1 為乙基， R^5 及 R^6 為氫，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 278：

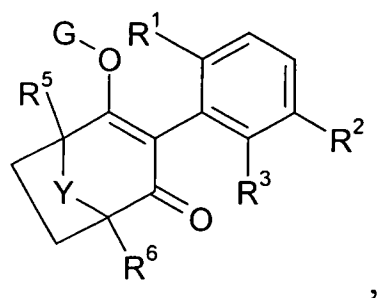
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O， R^1 為甲基， R^5 為氫及 R^6 為甲基，G 為氫，而 R^2 及 R^3 如表 85 中所定義。

表 279：

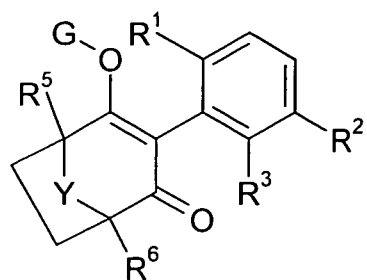
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 280：

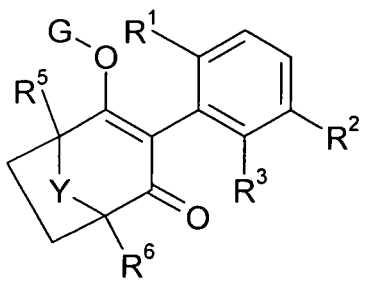
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 281：

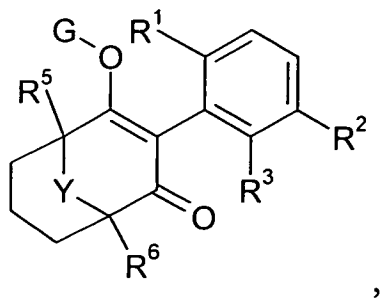
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 282：

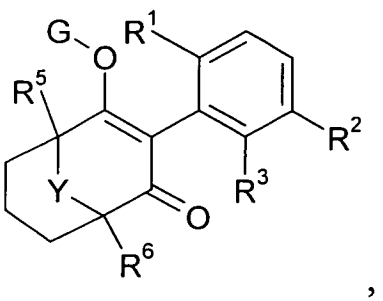
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 283：

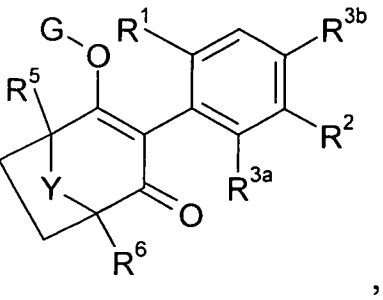
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，G 為氫，而 R² 及 R³ 如表 85 中所定義。

表 284：

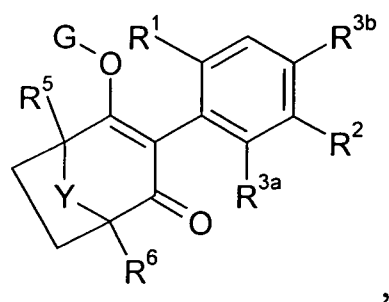
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O， R^1 及 R^{3a} 為甲基， R^5 及 R^6 為氫， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 285：

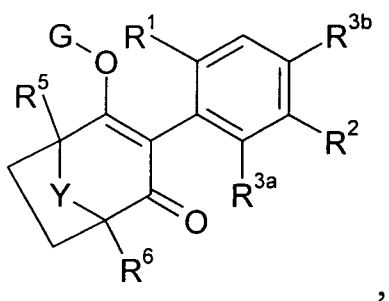
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O， R^1 為乙基及 R^{3a} 為甲基， R^5 及 R^6 為氫， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 286：

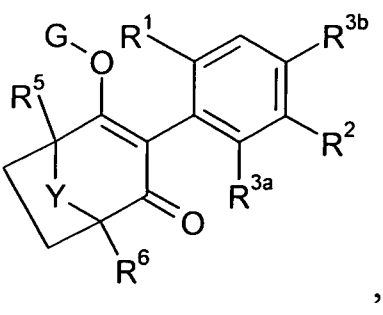
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O， R^1 及 R^{3a} 為乙基， R^5 及 R^6 為氫， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 287：

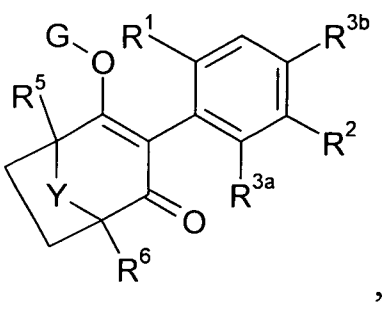
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 及 R^{3a} 為甲基，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 288：

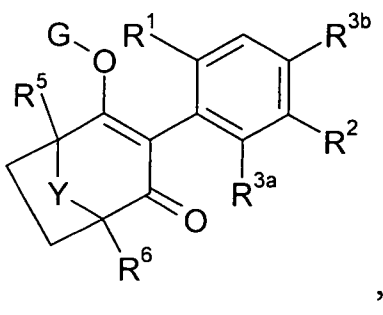
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基及 R^{3a} 為甲基，R⁵ 為氫及 R⁶ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 289：

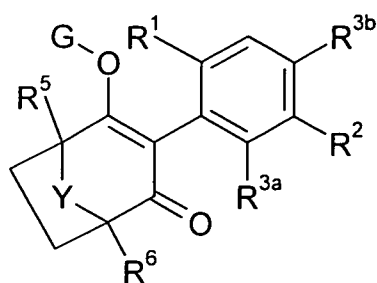
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O， R^1 及 R^{3a} 為乙基， R^5 為氫及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 290：

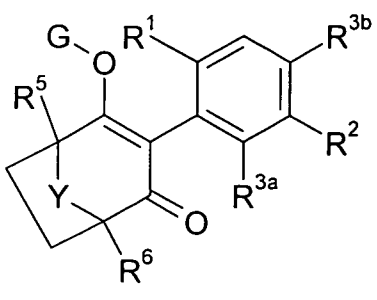
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O， R^1 及 R^{3a} 為甲基， R^5 及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 291：

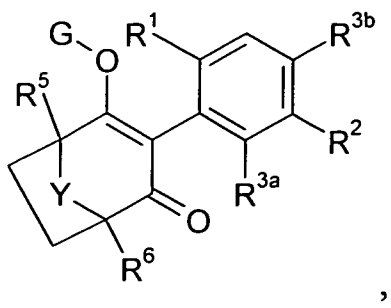
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O， R^1 為乙基及 R^{3a} 為甲基， R^5 及 R^6 為甲基， R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R^2 如表 85 中所定義。

表 292：

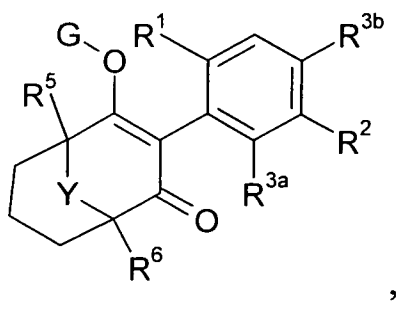
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 及 R^{3a} 為乙基，R⁵ 及 R⁶ 為甲基，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

表 293：

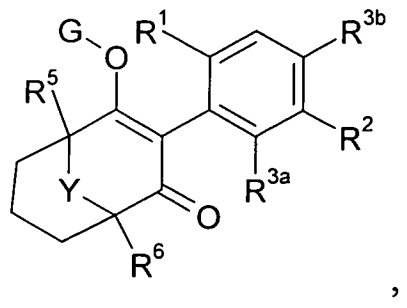
該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



其中 Y 為 C=O，R¹ 及 R^{3a} 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

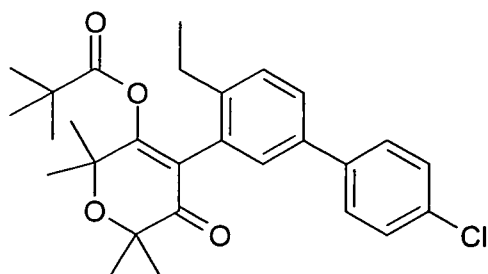
表 294：

該表涵蓋 126 種下列類型的化合物：



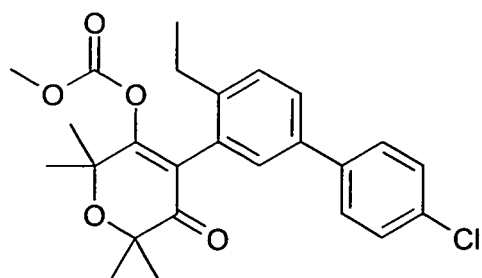
其中 Y 為 C=O，R¹ 為乙基及 R^{3a} 為甲基，R⁵ 及 R⁶ 為氫，R^{3b} 為甲基及 G 為氫，而 R² 如表 85 中所定義。

實施例 30：2,2-二甲基丙酸 4-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基-5-酮基-5,6-二氫-2H-吡喃-3-酯之製備



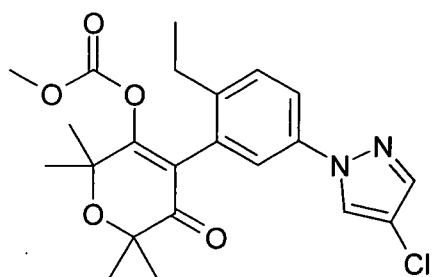
將三乙胺（0.031 毫升，0.22 毫莫耳）加入溶解在無水二氯甲烷（3 毫升）中的 4-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.077 公克，0.20 毫莫耳）之溶液中，接著加入三甲基乙醯氯（0.027 毫升，0.22 毫莫耳）。將該混合物在室溫下攪拌 3 小時，接著以二氯甲烷（15 毫升）稀釋及以蒸餾水（2 x 10 毫升）清洗。將有機部分合併，經硫酸鎂乾燥，接著濃縮，得到粗油，將其以快速層析法（100% 己烷至 9：1 之比的己烷 / 乙酸乙酯）純化，以供應成為無色膠的 2,2-二甲基丙酸 4-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基-5-酮基-5,6-二氫-2H-吡喃-3-酯（0.090 公克）。

實施例 31：碳酸 4-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基-5-酮基-5,6-二氫-2H-吡喃-3-酯甲酯之製備



將三乙胺（0.152 毫升，1.09 毫莫耳）及氯基甲酸甲酯（0.084 毫升，1.09 毫莫耳）加入在無水氯仿（3 毫升）中的 4-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.141 公克，0.366 毫莫耳）之溶液中，並將混合物在室溫下攪拌 2 小時。將溶液移除及將殘餘物以管柱層析法（5：1 之比的己烷 / 乙酸乙酯）直接純化，以供應成為白色固體的碳酸 4-(4'-氯基-4-乙基聯苯-3-基)-2,2,6,6-四甲基-5-酮基-5,6-二氫-2H-吡喃-3-酯甲酯（0.150 公克）。

實施例 32：碳酸 4-[5-(4-氯基吡唑-1-基)-2-乙苯基]-2,2,6,6-四甲基-5-酮基-5,6-二氫-2H-吡喃-3-酯甲酯之製備

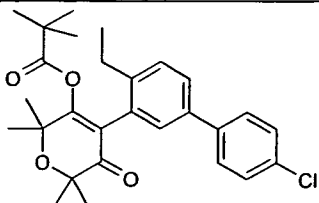
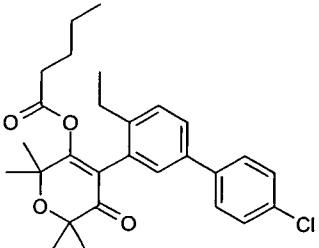
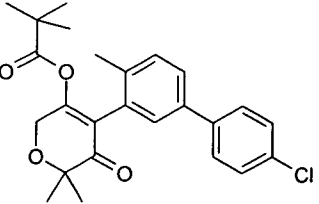
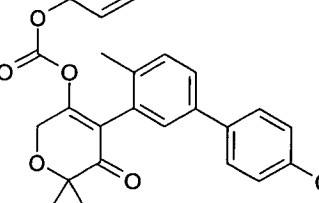
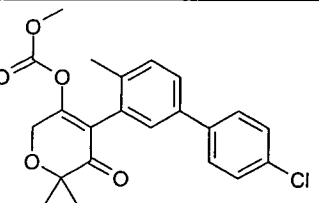
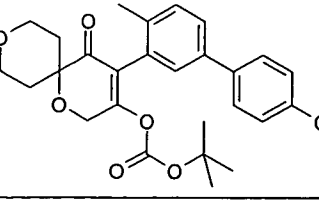
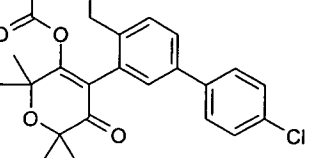


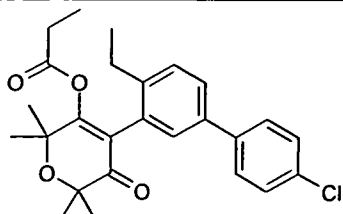
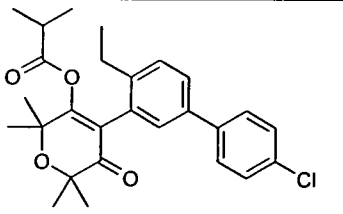
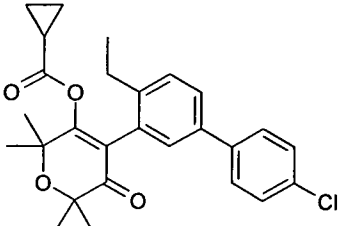
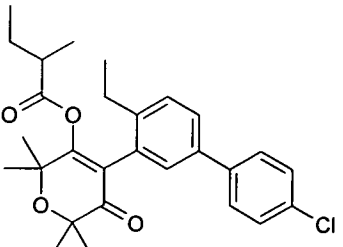
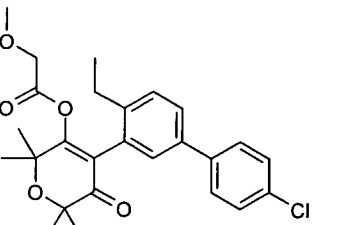
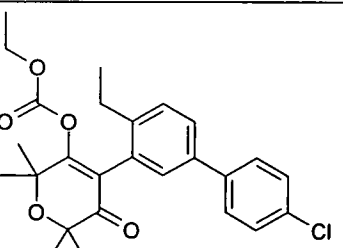
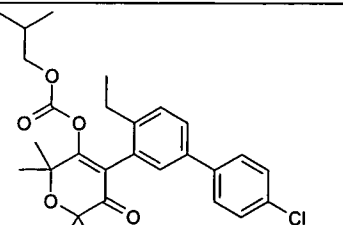
將脫氯之二甲基亞砷（1.5 毫升）加入 4-(5-溴基-2-乙苯基)-2,2,6,6-四甲基吡喃-3,5-二酮（0.15 公克，0.42 毫莫耳）、4-氯基吡喃（0.065 公克，0.63 毫莫耳）、L-脯胺酸（0.049 公克，0.42 毫莫耳）、碘化亞銅(I)（0.080 公克，

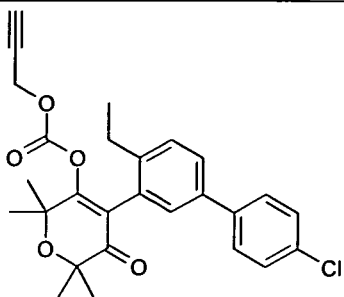
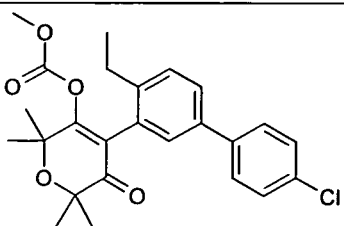
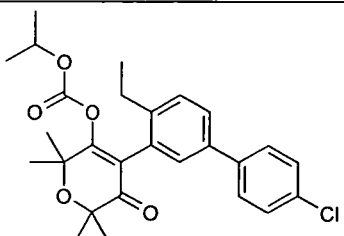
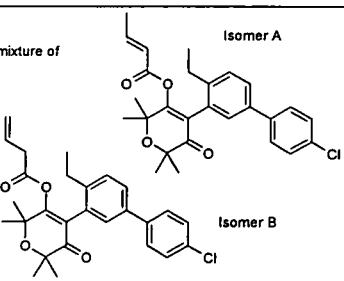
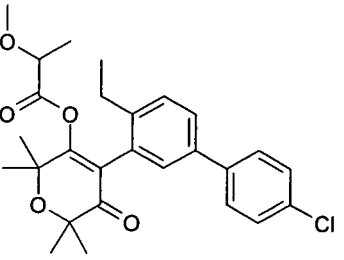
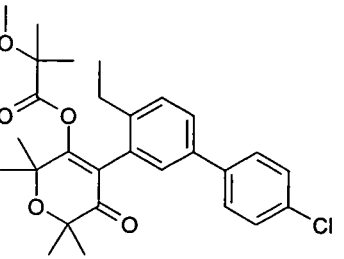
0.42 毫莫耳) 與無水粉末狀磷酸鉀 (0.36 公克, 1.68 毫莫耳) 之混合物中。接著將該混合物在微波照射下於 160°C 下加熱 30 分鐘, 接著冷卻至室溫, 以二氯甲烷 (150 毫升) 稀釋及以 1M 水性氫氯酸 (2 x 50 毫升) 清洗。將有機部分合併, 經無水硫酸鎂乾燥, 接著在真空中濃縮。接著將二乙醚加入粗油中, 以沉澱產物, 將其過濾及再溶解在二氯甲烷 (20 毫升) 中。接著將三乙胺 (0.16 毫升, 1.16 毫莫耳) 加入該溶液中, 接著加入氯基甲酸甲酯 (0.090 毫升, 1.16 毫莫耳) 及在室溫下攪拌 3 小時。將溶劑在減壓下移除, 並將殘餘物在矽膠上以管柱層析法 (3:1 之比的己烷 / 乙酸乙酯) 直接純化, 以供應成為無色油的碳酸 4-[5-(4-氯基吡唑-1-基)-2-乙苯基]-2,2,6,6-四甲基-5-酮基-5,6-二氫-2H-吡喃-3-酯甲酯 (0.075 公克)。

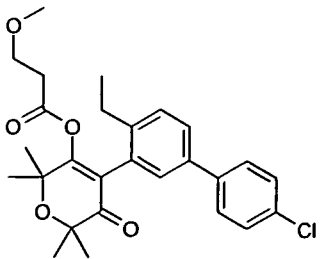
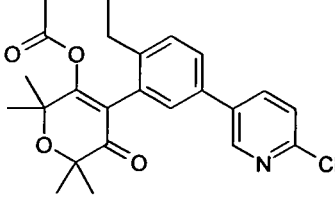
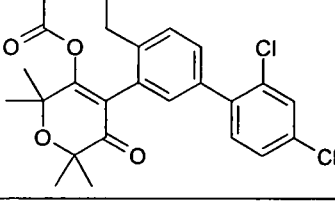
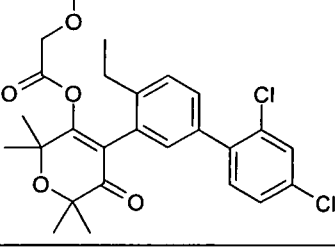
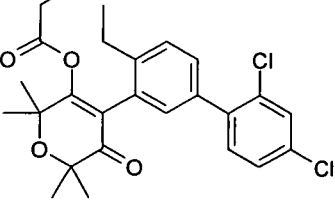
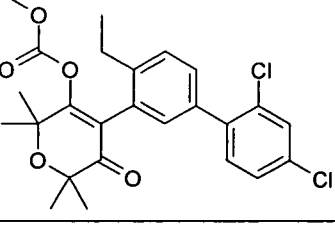
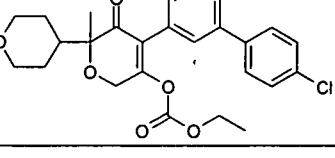
在下列表 D 中的額外化合物係以類似的方法使用適當的原料所製備。

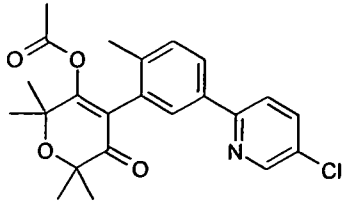
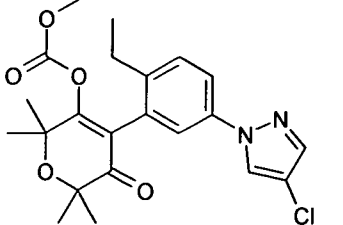
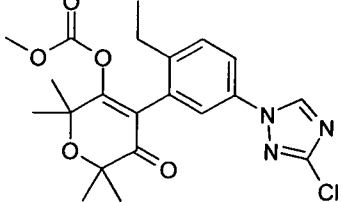
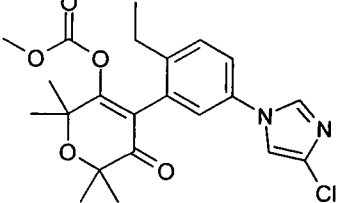
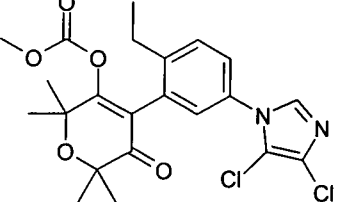
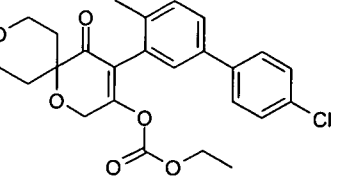
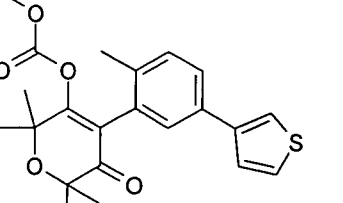
表 D

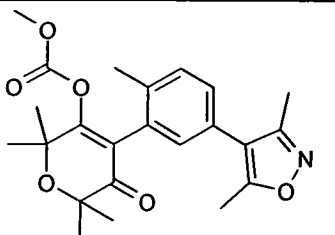
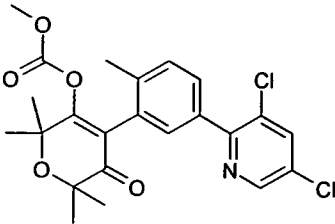
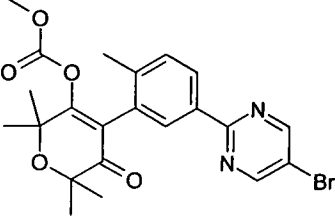
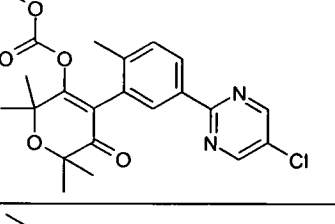
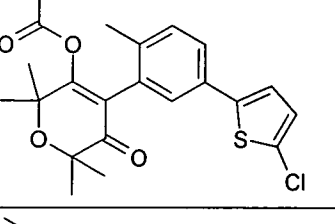
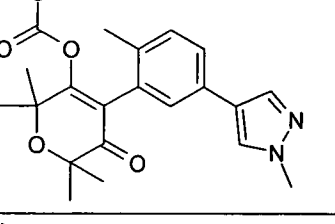
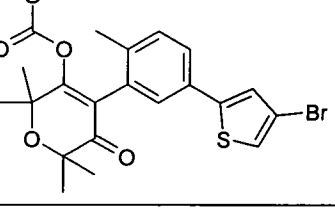
化合物編號	結構	¹ H nmr (CDCl ₃ , 除非有另外陳述) 或其他的物理數據
D-1		δ 7.49 (m, 2H), 7.45 (dd, 1H), 7.38 (m, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.16 (d, 1H), 2.49 (m, 2H), 1.54 (d, 12H), 1.20 (t, 3H), 0.85 (s, 9H).
D-2		δ 7.49 (m, 2H), 7.47 (dd, 1H), 7.39 (m, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.14 (d, 1H), 2.49 (m, 2H), 2.05 (t, 2H), 1.54 (d, 12H), 1.20 (t, 3H), 1.18 (m, 2H), 0.92 (m, 2H), 0.69 (t, 3H).
D-3		δ 7.46 (m, 2H), 7.41 (dd, 1H), 7.37 (m, 2H), 7.26 (d, 1H), 7.17 (d, 1H), 4.58 (s, 2H), 2.14 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.50 (s, 3H), 0.89 (s, 9H).
D-4		Oil, LC-MS (ES ⁺): 429, 427 (M+H) ⁺
D-5		泡沫, LC-MS (ES ⁺): 403, 401 (M+H) ⁺
D-6		δ 7.45 (m, 2H), 7.42 (dd, 1H), 7.37 (m, 2H), 7.26 (d, 1H), 7.16 (d, 1H), 4.59 (s, 2H), 3.90 (m, 2H), 3.79 (m, 2H), 2.15 (m, 2H), 2.13 (s, 3H), 1.97 (m, 1H), 1.85 (m, 1H), 0.90 (s, 9H).
D-7		δ 7.50-7.45 (m, 3H), 7.37 (dd, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.16 (s, 1H), 2.48 (q, 2H), 1.76 (s, 3H), 1.53 (s, 6H), 1.56 (s, 6H), 1.19 (t, 3H)

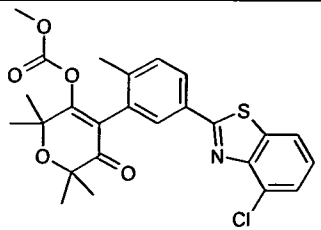
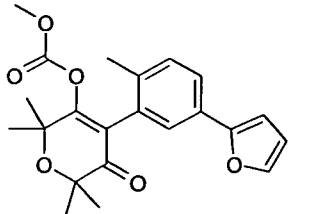
化合物編號	結構	¹ H nmr (CDCl ₃ , 除非有另外陳述) 或其他的物理數據
D-8		δ 7.50-7.44 (m, 3H), 7.37 (d, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 2.48 (q, 2H), 2.02 (m, 2H), 1.54 (d, 12H), 1.18 (t, 3H), 0.72 (t, 3H).
D-9		δ 7.49-7.42 (m, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.14 (s, 1H), 2.48 (q, 2H), 2.32 (m, 1H), 1.53 (s, 12H), 1.18 (t, 3H), 0.78 (d, 3H), 0.73 (d, 3H).
D-10		δ 7.49-7.44 (m, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.13 (s, 1H), 2.45 (q, 2H), 1.56 (s, 6H), 1.52 (s, 6H), 1.38 (m, 1H), 1.18 (t, 3H), 0.65-0.60 (m, 2H), 0.60-0.47 (m, 2H).
D-11		δ 7.47-7.43 (m, 3H), 7.38-7.36 (m, 2H), 7.30 (d, 1H), 7.15 (m, 1H), 2.51-2.45 (m, 2H), 2.18-2.10 (m, 1H), 1.55-1.53 (m, 12H), 1.41-1.28 (m, 1H), 1.22-1.10 (m, 4H), 0.72 (app. dd, 3H), 0.58 (q, 3H).
D-12		δ 7.50-7.44 (m, 3H), 7.37 (d, 2H), 7.33 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 3.67 (dd, 2H), 2.98 (s, 3H), 2.48 (q, 2H), 1.53 (s, 6H), 1.56 (s, 6H), 1.19 (t, 3H).
D-13		δ 7.50-7.44 (m, 3H), 7.37 (d, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 3.86 (q, 2H), 2.48 (q, 2H), 1.59 (s, 6H), 1.53 (s, 6H), 1.19 (t, 3H), 0.88 (t, 3H).
D-14		δ 7.49-7.43 (m, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.18 (s, 1H), 3.61 (m, 2H), 2.48 (q, 2H), 1.61-1.51 (m, 13H), 1.19 (t, 3H), 0.62 (d, 6H).

化合物編號	結構	¹ H nmr (CDCl ₃ , 除非有另外陳述) 或其他的物理數據
D-15		δ 7.50-7.44 (m, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.18 (s, 1H), 4.38 (s, 2H), 2.47 (q, 2H), 2.29 (s, 1H), 1.59 (s, 6H), 1.53 (s, 6H), 1.18 (t, 3H).
D-16		δ 7.50-7.45 (m, 3H), 7.37 (d, 2H), 7.33 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 3.46 (s, 3H), 2.47 (q, 2H), 1.59 (s, 6H), 1.53 (s, 6H), 1.19 (t, 3H).
D-17		δ 7.48-7.43 (m, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.33 (d, 1H), 7.19 (s, 1H), 4.49 (m, 1H), 2.48 (q, 2H), 1.60 (s, 6H), 1.53 (d, 6H), 1.19 (t, 3H), 0.91 (app. dd, 6H).
D-18	mixture of  Isomer A Isomer B	δ 7.48-7.13 (m, 7H, 異構物 A 和 B), 6.83-6.74 (m, 0.66H, 異構物 A), 5.58 (dd, 0.66H, 異構物 A), 5.42-5.32 (m, 0.33H, 異構物 B), 4.95-4.86 (m, 0.66H, 異構物 B), 2.77 (dd, 0.66H, 異構物 B), 2.50-2.43 (m, 2H, 異構物 A 和 B), 1.74 (ddd, 2H, 異構物 A), 1.57-1.53 (m, 12H, 異構物 A 和 B), 1.2 (m, 3H, 異構物 A 和 B)
D-19		δ 7.48-7.42 (m, 3H), 7.39-7.36 (m, 2H), 7.32 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 3.59 (m, 1H), 2.94 (s, 3H), 2.48 (m, 2H), 1.55 (m, 12H), 1.19 (m, 3H), 0.96 (app. dd, 3H).
D-20		δ 7.47-7.43 (m, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.17 (s, 1H), 2.83 (s, 3H), 2.49 (q, 2H), 1.59-1.52 (m, 12H), 1.07 (app. d. 6H).

化合物編號	結構	¹ H nmr (CDCl ₃ , 除非有另外陳述) 或其他的物理數據
D-21		δ 7.49-7.44 (m, 3H), 7.36 (d, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.15 (s, 1H), 3.27 (t, 2H), 3.14 (s, 3H), 2.48 (q, 2H), 2.27 (m, 2H), 1.56 (s, 6H), 1.53 (s, 6H), 1.18 (t, 3H).
D-22		δ 8.57 (s, 1H), 7.81 (dd, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.37 (m, 2H), 7.16 (s, 1H), 2.49 (q, 2H), 1.78 (s, 3H), 1.66 (s, 6H), 1.53 (s, 6H), 1.19 (t, 3H).
D-23		δ 7.46 (s, 1H), 7.33 (m, 2H), 7.27 (m, 2H), 6.98 (s, 1H), 2.48 (q, 2H), 1.55 (app. d, 6H), 1.50 (s, 6H), 1.21 (t, 3H).
D-24		δ 7.46 (s, 1H), 7.35 (m, 2H), 7.27 (m, 2H), 7.0 (d, 1H), 3.72 (m, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.50 (m, 2H), 1.54 (m, 12H), 1.21 (t, 3H).
D-25		δ 7.46 (s, 1H), 7.32 (m, 2H), 7.26 (m, 2H), 6.98 (d, 1H), 2.49 (q, 2H), 2.07 (q, 2H), 1.53 (m, 12H), 1.20 (t, 3H), 0.80 (t, 3H).
D-26		δ 7.46 (s, 1H), 7.34 (m, 2H), 7.27 (m, 2H), 7.0 (d, 1H), 3.50 (s, 3H), 2.50 (q, 2H), 1.58 (app. d, 6H), 1.52 (app. d, 6H), 1.20 (3H).
D-27		δ 7.50-7.15 (m, 7H), 4.73 (app. dd, 1H), 4.58 (app. dd, 1H), 4.06 (q, 2H), 4.03 (m, 2H), 3.40 (m, 2H), 2.27 (m, 1H), 2.16 和 2.14 (每一 s, 3H 一起), 1.80 (m, 1H), 1.59 (m, 3H), 1.44 和 1.41 (每一 s, 3H 一起), 1.10 (t, 3H).

化合物 編號	結構	^1H nmr (CDCl_3 , 除非有另外陳述) 或其他的物理數據
D-28		甲醇- d_4 δ 8.58 (1H, m), 7.90-7.80 (3H, m), 7.62 (1H, m), 7.32 (1H, d), 2.15 (3H, s), 1.75 (3H, s), 1.58 (3H, s), 1.54 (3H, s), 1.51 (3H, s), 1.47 (3H, s).
D-29		δ 7.88 (s, 1H), 7.60 (m, 2H), 7.36 (d, 1H), 7.25 (m, 1H), 3.51 (s, 3H), 2.47 (m, 2H), 1.60 (s, 6H), 1.52 (s, 6H), 1.19 (t, 3H).
D-30		δ 8.40 (s, 1H), 7.60 (dd, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.28 (m, 1H), 3.53 (s, 3H), 2.50 (m, 2H), 2.60 (s, 6H), 2.53 (app. d, 6H), 1.20 (t, 3H).
D-31		δ 7.65 (s, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.30 (dd, 1H), 7.17 (s, 1H), 7.20 (d, 1H), 3.53 (s, 3H), 2.49 (m, 2H), 1.60 (d, 6H), 1.53 (d, 6H), 1.20 (m, 3H).
D-32		δ 7.51 (s, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.30 (dd, 1H), 7.0 (d, 1H), 3.52 (s, 3H), 2.52 (m, 2H), 1.58 (m, 6H), 1.51 (m, 6H), 1.20 (t, 3H).
D-33		δ 7.47 (m, 2H), 7.45 (dd, 1H), 7.37 (m, 2H), 7.29 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 4.67 (s, 2H), 4.05 (q, 2H), 3.89 (m, 2H), 3.79 (m, 2H), 2.15 (m, 2H), 2.13 (s, 3H), 1.95 (m, 1H), 1.83 (m, 1H), 1.09 (t, 3H).
D-34		DMSO- d_6 δ 7.81 (m, 1H), 7.63 (m, 2H), 7.51 (dd, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.27 (d, 1H), 3.43 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.55 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.47 (s, 3H), 1.42 (s, 3H).

化合物編號	結構	¹ H nmr (CDCl ₃ , 除非有另外陳述) 或其他的物理數據
D-35		DMSO-d ₆ δ 7.34 (d, 1H), 7.28 (dd, 1H), 6.97 (d, 1H), 3.44 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.53 (app. d, 6H), 1.46 (s, 3H), 1.41 (s, 3H).
D-36		DMSO-d ₆ δ 8.70 (d, 1H), 8.33 (d, 1H), 7.58 (dd, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.25 (d, 1H), 3.47 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.52 (app. d, 6H), 1.46 (s, 3H), 1.41 (s, 3H).
D-37		DMSO-d ₆ δ 9.02 (s, 2H), 8.20 (dd, 1H), 7.93 (d, 1H), 7.37 (d, 1H), 3.38 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.48 (s, 3H), 1.42 (s, 3H), 1.40 (s, 3H).
D-38		DMSO-d ₆ δ 9.00 (s, 2H), 8.26 (dd, 1H), 7.98 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 3.42 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.56 (s, 3H), 1.53 (s, 3H), 1.47 (s, 3H), 1.44 (s, 3H).
D-39		DMSO-d ₆ δ 7.52 (dd, 1H), 7.36 (d, 1H), 7.28 (d, 1H), 7.20 (d, 1H), 7.14 (d, 1H), 3.45 (s, 3H), 2.05 (s, 3H), 1.55 (s, 3H), 1.51 (s, 3H), 1.46 (s, 3H), 1.42 (s, 3H).
D-40		(DMSO-d ₆ δ 8.05 (s, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.41 (dd, 1H), 7.17 (d, 1H), 7.10 (d, 1H), 3.81 (s, 3H), 3.39 (s, 3H), 1.97 (s, 3H), 1.51 (3H, s), 1.47 (3H, s), 1.42 (3H, s), 1.38 (3H, s).
D-41		DMSO-d ₆ δ 7.62 (d, 1H), 7.52 (dd, 1H), 7.50 (d, 1H), 7.25 (m, 2H), 3.40 (s, 3H), 2.01 (s, 3H), 1.52 (s, 3H), 1.47 (s, 3H), 1.42 (s, 3H), 1.38 (s, 3H).

化合物編號	結構	¹ H nmr (CDCl ₃ , 除非有另外陳述) 或其他的物理數據
D-42		DMSO-d ₆ δ 8.10 (dd, 1H), 7.98 (dd, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 7.44 (m, 2H), 3.43 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.54 (s, 3H), 1.50 (s, 3H), 1.44 (s, 3H), 1.42 (s, 3H).
D-43		DMSO-d ₆ δ 7.69 (d, 1H), 7.55 (dd, 1H), 7.25 (app. d, 2H), 6.86 (d, 1H), 6.54 (m, 1H), 3.40 (s, 3H), 2.01 (s, 3H), 1.51 (s, 3H), 1.48 (s, 3H), 1.42 (s, 3H), 1.38 (s, 3H).

生物實施例

實施例 A

將各種試驗物種的種子播種在罐子內的標準土壤中。在溫室內受控制的條件下栽種 1 天之後（萌芽前）或在栽種 10 天之後（萌芽後），將植物以在 0.6 毫升丙酮及含有 10.6% Emulsogen EL（登錄號碼 61791-12-6）、42.2% N-甲基吡咯啉酮、42.2% 二伸丙甘醇單甲醚（登錄號碼 34590-94-8）及 0.2% X-77（登錄號碼 11097-66-8）之 45 毫升調配溶液中的技術級活性成分之調配物所衍生之水性噴霧溶液噴霧。接著使試驗植物在適宜的條件下在溫室中生長，直到經萌芽後之後 15 天及經萌芽前之後 20 天為止，評估試驗（100=對植物完全損害；0=對植物沒有任何損害）。

試驗植物：

大穗看麥娘（*Alopecurus myosuroides*）（ALOMY）、燕麥草（*Avena fatua*）（AVEFA）、黑麥草（*Lolium perenne*）（LOLPE）、大狗尾草（*Setaria faberi*）（SETFA）、雞

窩草 (*Digitaria sanguinalis*) (DIGSA) 、稗草 (*Echinochloa crus-galli*) (ECHCG)

萌芽前活性

化合物編號	施予率 公克 / 公頃	ALOM Y	AVEF A	LOLP E	SETFA	DIGSA	ECHC G
A-1	500	40	10	10	70	70	50
A-2	500	50	50	60	70	10	100
A-3	500	30	20	20	50	70	70
A-5	500	60	50	50	100	100	100
A-9	500	20	30	20	60	50	50
A-10	250	40	50	60	100	100	100
A-34	250	60	50	100	100	100	100
A-35	250	70	70	80	100	80	100
A-36	250	60	60	80	90	100	100
A-38	250	50	10	60	90	30	70
A-40	250	30	10	20	70	70	70
A-42	250	100	30	50	100	100	80
A-43	250	80	90	80	100	100	100
A-44	250	60	20	80	50	100	70
A-45	250	50	50	80	90	100	70
A-47	250	30	20	30	60	70	70
A-48	250	30	10	0	60	60	100
A-49	250	0	20	20	50	50	100

A-51	250	0	0	40	10	50	50
A-52	250	0	0	10	80	100	70
A-53	250	10	0	0	10	60	10
B-1	500	40	60	60	100	100	100
C-1	500	20	20	30	30	30	50
C-2	250	10	10	10	70	100	100
C-3	250	60	80	10	60	90	70
D-2	500	30	60	80	100	100	80
D-5	500	0	20	0	20	60	50

萌芽後活性

化合物編號	施予率 公克 / 公頃	ALOM Y	AVEF A	LOLP E	SETFA	DIGSA	ECHC G
A-1	125	10	0	80	50	0	70
A-2	125	20	20	0	80	50	80
A-3	125	0	0	0	60	40	70
A-5	125	70	70	70	80	100	100
A-9	125	50	0	30	80	80	80
A-10	125	30	20	0	50	100	100
A-34	125	70	20	80	90	90	100
A-35	125	80	50	70	80	80	100
A-36	125	40	0	70	60	70	70
A-38	125	50	60	0	80	70	90
A-40	125	70	60	60	70	70	100

A-42	125	80	90	70	100	100	100
A-43	125	80	90	80	100	100	100
A-44	125	40	60	60	30	70	100
A-45	125	20	70	70	80	100	100
A-47	125	90	90	70	50	80	100
A-48	125	70	40	0	40	40	40
A-49	125	50	70	80	50	70	80
A-51	125	10	20	0	40	60	80
A-52	125	90	70	30	60	70	90
A-53	125	30	10	10	0	50	90
B-1	125	30	30	80	90	100	100
C-1	125	50	70	30	80	100	100
C-2	125	70	70	60	90	90	100
C-3	125	70	80	50	90	100	100
D-2	125	20	10	20	90	90	90
D-5	125	10	40	40	70	20	60

實施例 B

將各種試驗物種的種子播種在罐子內的標準土壤中。在溫室內受控制的條件下（在白天 / 夜晚的 24°C / 16°C 下；14 小時日照；65% 濕度）栽種 1 天之後（萌芽前）或在栽種 8 天之後（萌芽後），將植物以在含有 0.5% Tween 20（聚氧乙烯山梨醇酐單月桂酸酯，CAS RN 9005-64-5）的丙酮 / 水（50：50）溶液中的技術級活性成分之調配物所衍生之水性噴霧溶液噴霧。接著使試驗植物在溫室內受控

制的條件下（在白天 / 夜晚的 24°C / 16°C 下；14 小時日照；65% 濕度）在溫室中生長及每天澆水兩次。在經萌芽前及後 13 天之後，評估試驗（100=對植物完全損害；0=對植物沒有任何損害）。

試驗植物：

大穗看麥娘（*Alopecurus myosuroides*）（ALOMY）、燕麥草（*Avena fatua*）（AVEFA）、大狗尾草（*Setaria faberi*）（SETFA）、稗草（*Echinochloa crus-galli*）（ECHCG）、龍葵（*Solanum nigrum*）（SOLNI）及粗糙豬草（*Amaranthus retroflexus*）（AMARE）

萌芽前活性

化合物編號	施予率 公克 / 公頃	SOLNI	AMAR E	SETFA	ALOM Y	ECHC G	AVEF A
A-4	250	-	20	100	70	100	70
A-15	1000	100	100	50	50	100	50
A-16	1000	0	0	100	30	100	20
A-20	1000	40	0	100	90	100	60
A-21	1000	50	60	100	100	90	50
A-22	1000	60	30	40	40	90	20
A-24	1000	20	20	90	80	100	60
A-25	1000	0	0	20	70	80	30
A-26	1000	0	0	100	80	100	80
A-27	1000	20	10	90	80	100	60

A-29	1000	0	0	100	90	100	80
A-30	1000	0	0	100	80	100	70
A-31	1000	0	0	100	50	100	0
A-37	1000	0	0	20	40	30	20
A-54	1000	0	20	90	70	100	0
A-56	1000	20	0	0	10	30	40
A-58	1000	20	20	100	80	100	60
A-59	250	-	0	40	30	90	40
A-60	250	-	0	20	0	20	0
A-62	250	-	0	60	20	0	20
A-63	250	-	0	30	0	0	0
A-64	250	-	0	40	0	40	20
A-65	250	-	0	0	0	90	0
A-66	250	-	0	50	0	60	40
A-67	250	-	0	90	40	60	0
A-69	250	-	0	80	0	60	0
A-71	250	-	0	100	40	80	20
A-72	250	-	0	0	0	40	0
A-73	250	-	0	20	0	10	0
A-74	250	-	10	50	20	80	0
A-75	250	-	0	90	30	90	30
A-76	250	-	0	100	60	70	50
A-77	250	-	0	20	10	0	0
A-79	250	-	0	100	40	80	40

A-80	250	-	0	70	30	40	0
A-81	250	-	0	100	80	100	90
A-82	250	-	20	90	80	100	90
A-83	250	-	0	100	50	90	40
A-87	250	-	0	0	0	0	0
A-88	250	-	0	0	0	0	10
A-89	250	-	0	50	0	0	0
A-90	250	-	0	0	0	0	0
A-92	250	-	0	60	10	50	0
A-96	250	-	0	0	0	0	0
A-97	250	-	0	60	0	50	0
A-98	250	-	50	90	0	90	0
A-99	250	-	20	100	80	100	50
A-100	250	-	60	100	20	80	90
A-101	250	-	0	100	70	100	100
A-102	250	-	0	90	30	90	0
A-103	250	-	0	0	0	0	0
A-104	250	-	0	0	0	0	0
A-105	250	-	0	0	0	0	0
A-122	250	-	0	100	40	90	100
A-123	250	-	0	100	50	70	80
A-124	250	-	0	100	50	70	60
A-125	250	-	0	100	70	90	80
A-126	250	-	0	100	30	80	90

A-127	250	-	0	90	30	50	70
A-128	250	-	0	90	40	70	80
A-129	250	-	0	90	20	40	30
A-130	250	-	0	90	20	40	20
A-132	250	-	0	0	0	0	0
A-133	250	-	0	80	10	0	70
A-135	250	-	0	100	80	100	100
A-136	250	-	0	30	20	90	80
A-137	250	-	0	100	70	100	90
A-138	250	-	20	100	90	100	90
A-139	250	-	0	70	0	30	0
A-141	250	-	0	80	20	100	30
A-142	250	-	0	100	60	70	70
A-143	250	-	0	70	20	0	0
A-144	250	-	30	100	100	90	80
A-147	250	-	0	70	100	100	60
A-149	250	-	0	90	60	100	30
A-150	250	-	0	100	90	100	40
A-151	250	-	0	100	100	100	100
A-152	250	-	0	100	70	100	90
A-153	250	-	0	100	60	100	50
A-154	250	-	0	90	50	100	20
A-155	250	-	0	100	50	100	0
B-2	1000	30	90	0	0	70	20

B-4	1000	0	0	0	0	30	0
B-6	1000	90	100	0	0	0	0
B-7	1000	20	0	60	0	50	0
B-9	250	0	0	0	0	0	0
B-10	250	20	0	50	0	30	0
B-12	250	0	0	50	0	30	0
B-13	250	0	0	20	0	30	20
B-18	250	0	0	20	40	0	0
B-23	250	0	0	0	0	10	0
B-25	250	0	0	0	0	0	0
B-27	250	0	0	0	0	0	0
B-28	250	0	0	0	0	0	0
B-29	250	0	0	30	0	20	0
B-30	250	0	0	0	0	0	0
B-31	250	0	0	50	0	50	20
C-4	250	-	0	0	0	0	0
C-5	250	-	0	0	0	0	0
C-6	250	-	0	0	0	0	0
C-7	250	-	0	0	0	0	0
C-8	250	-	0	0	0	0	0
C-9	250	-	0	0	0	0	0
C-10	250	-	0	0	20	40	20
C-11	250	-	0	0	0	0	80
C-12	250	-	0	90	0	20	90

C-13	250	-	0	80	20	30	90
D-7	1000	0	0	100	60	90	30
D-8	1000	0	0	90	40	90	0
D-9	1000	0	0	90	20	70	0
D-10	1000	0	0	100	50	100	0
D-11	1000	0	0	90	20	20	0
D-12	1000	0	0	100	90	100	60
D-13	1000	0	0	90	50	90	20
D-14	1000	0	0	90	50	60	20
D-15	1000	0	0	100	80	100	60
D-16	1000	0	0	100	50	90	0
D-17	1000	0	0	90	20	80	0
D-18	1000	0	0	100	70	100	50
D-19	1000	0	0	100	70	100	20
D-20	1000	0	0	90	30	60	0
D-21	1000	-	0	100	90	100	50
D-22	250	-	0	100	60	100	50
D-23	250	-	0	90	0	100	0
D-24	250	-	20	90	0	100	0
D-25	250	-	0	90	20	90	0
D-28	250	-	0	80	30	20	40
D-32	250	-	0	80	20	60	80

萌芽後活性

化合物編	施予率	SOLNI	AMAR	SETFA	ALOM	ECHC	AVEF

號	公 克 / 公 頃		E		Y	G	A
A-4	250	-	20	100	90	100	80
A-15	1000	10	90	10	10	50	20
A-16	1000	10	40	100	30	100	30
A-20	1000	80	20	100	90	100	90
A-21	1000	20	20	60	40	90	60
A-22	1000	90	0	20	30	80	0
A-24	1000	70	90	100	100	100	80
A-25	1000	70	100	70	70	90	0
A-26	1000	50	100	100	100	100	100
A-27	1000	50	100	100	80	100	80
A-29	1000	60	40	100	100	100	100
A-30	1000	70	70	100	90	100	100
A-31	1000	60	0	100	100	100	90
A-37	1000	70	0	80	70	90	30
A-54	1000	0	0	80	80	90	50
A-56	1000	20	20	80	80	80	50
A-58	1000	30	70	90	90	100	90
A-59	250	-	0	90	30	100	50
A-60	250	-	60	80	20	80	0
A-62	250	-	0	100	70	100	70
A-63	250	-	0	100	90	100	60
A-64	250	-	20	90	20	100	0

A-65	250	-	10	70	20	90	0
A-66	250	-	10	100	20	100	30
A-67	250	-	100	30	80	100	80
A-69	250	-	90	100	70	100	90
A-71	250	-	100	100	30	100	30
A-72	250	-	60	80	20	80	0
A-73	250	-	0	90	20	90	0
A-74	250	-	70	90	0	90	0
A-75	250	-	0	100	90	100	90
A-76	250	-	0	100	90	100	70
A-77	250	-	0	90	70	100	60
A-79	250	-	0	100	80	100	50
A-80	250	-	0	90	30	100	0
A-81	250	-	0	100	100	100	100
A-82	250	-	0	100	100	100	100
A-83	250	-	0	100	80	100	80
A-87	250	-	0	80	10	80	0
A-88	250	-	0	90	50	90	10
A-89	250	-	0	80	80	90	50
A-90	250	-	0	90	40	90	20
A-92	250	-	0	90	50	100	0
A-96	250	-	0	90	50	100	30
A-97	250	-	0	70	40	90	30
A-98	250	-	30	100	50	100	70

A-99	250	-	0	100	90	100	90
A-100	250	-	0	100	90	100	90
A-101	250	-	0	100	100	100	100
A-102	250	-	0	30	20	70	0
A-103	250	-	0	100	10	100	0
A-122	250	-	40	100	80	100	50
A-123	250	-	0	100	90	100	70
A-124	250	-	0	100	80	100	90
A-125	250	-	0	100	100	100	90
A-126	250	-	0	100	70	100	90
A-127	250	-	0	100	80	100	40
A-128	250	-	0	100	80	100	90
A-129	250	-	0	90	70	90	80
A-130	250	-	0	100	40	100	40
A-132	250	-	0	90	20	70	30
A-133	250	-	70	100	20	100	80
A-135	250	-	0	100	100	100	100
A-136	250	-	0	70	80	100	100
A-137	250	-	30	100	90	100	90
A-138	250	-	60	100	100	100	100
A-139	250	-	50	80	30	100	50
A-141	250	-	0	80	50	100	50
A-142	250	-	0	80	100	100	80
A-143	250	-	0	90	90	100	80

A-144	250	-	40	100	100	100	100
A-147	250	-	0	70	100	100	90
A-149	250	-	20	100	90	100	70
A-150	250	-	0	100	90	100	80
A-151	250	-	0	100	100	100	100
A-152	250	-	0	100	100	100	100
A-153	250	-	30	100	100	100	100
A-154	250	-	0	100	100	100	70
A-155	250	-	40	100	100	100	90
B-2	1000	40	70	20	0	80	0
B-4	1000	40	70	90	80	90	30
B-6	1000	0	0	30	20	60	0
B-7	1000	70	70	70	20	60	20
B-9	250	20	40	70	40	80	0
B-10	250	0	40	80	40	90	20
B-12	250	0	30	90	60	100	0
B-13	250	0	20	90	0	80	30
B-18	250	0	0	70	10	60	0
B-23	250	0	0	70	30	60	0
B-25	250	0	0	20	20	70	0
B-27	250	0	0	60	70	80	0
B-28	250	0	0	70	0	70	0
B-29	250	30	20	80	30	100	0
B-30	250	10	0	70	20	70	0

B-31	250	0	0	90	10	90	0
C-4	250	-	20	70	60	70	30
C-5	250	-	0	90	70	100	70
C-6	250	-	40	30	20	60	0
C-7	250	-	0	30	20	60	0
C-8	250	-	0	40	20	60	0
C-9	250	-	0	10	50	70	40
C-10	250	-	0	20	20	70	50
C-11	250	-	20	30	70	80	60
C-12	250	-	0	90	80	90	90
C-13	250	-	20	100	80	100	90
D-7	1000	0	0	100	90	100	70
D-8	1000	0	0	100	60	100	10
D-9	1000	0	0	90	30	100	0
D-10	1000	0	20	100	90	100	20
D-11	1000	0	0	90	40	100	0
D-12	1000	0	0	100	90	100	90
D-13	1000	0	0	100	60	100	0
D-14	1000	0	0	100	20	100	10
D-15	1000	0	0	100	80	100	60
D-16	1000	0	0	100	90	100	20
D-17	1000	0	10	100	60	100	20
D-18	1000	0	20	100	100	100	90
D-19	1000	0	0	100	90	100	80

D-20	1000	0	20	100	100	100	90
D-21	1000	30	10	100	100	100	90
D-22	250	-	0	100	90	100	100
D-23	250	-	0	90	0	100	0
D-24	250	-	0	100	0	100	20
D-25	250	-	0	90	0	90	20
D-28	250	-	0	80	80	90	50
D-32	250	-	0	80	50	90	70

【圖式簡單說明】

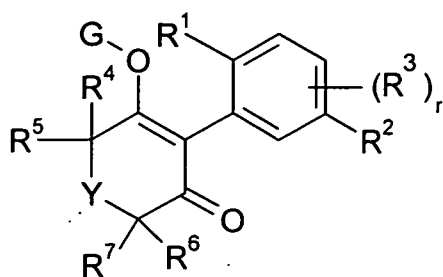
無

【主要元件符號說明】

無

十、申請專利範圍：

1. 一種式(I)化合物，



(I),

其中： R^1 為鹵素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 鹵烯基、 C_2 - C_4 炔基、 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 烷基亞磺基、 C_1 - C_4 烷基磺基、硝基或氰基；

R^2 為苯基、噻吩基、呋喃基、吡咯基、異噻唑基、噻唑基、異噻唑基、噻唑基、吡唑基、咪唑基、三唑基、四唑基、吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、三吡嗪基、噻二唑基、噻二唑基或噻吩基，其中這些環未被取代或被鹵素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 鹵烯基、 C_2 - C_4 炔基、 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 烷基亞磺基、 C_1 - C_4 烷基磺基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺基、 C_1 - C_4 鹵烷基磺基、硝基或氰基取代；

r 為 0、1 或 2；

如果 r 為 1，則 R^3 為鹵素或 C_1 - C_6 烷基；或如果 r 為 2，則取代基 R^3 彼此獨立為鹵素或 C_1 - C_6 烷基；

R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 彼此獨立為氫、 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、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺基、 C_1 - C_4 烷基磺基、硝基或氰基；

基、 C_1-C_4 烷基亞磺醯基 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 烷基磺醯基 C_1-C_4 烷基； C_5-C_7 環烷基或被 C_1 -或 C_2 烷基或 C_1 -或 C_2 鹵烷基取代之 C_5-C_7 環烷基且其中亞甲基視需要被氧或硫原子或亞磺醯基或磺醯基代替； C_5-C_7 環烷基 C_1-C_5 烷基或被 C_1 - C_2 烷基或 C_1 -或 C_2 鹵烷基取代之 C_5-C_7 環烷基 C_1-C_5 烷基且其中亞甲基視需要被氧或硫原子或亞磺醯基或磺醯基代替；或

R^4 與 R^5 ，或 R^6 與 R^7 連結形成 5-7 員飽和或不飽和環，其中亞甲基視需要被氧或硫原子代替；或

R^4 與 R^7 連結形成 5-7 員飽和或不飽和環，其未被取代或被 C_1 -或 C_2 烷基、 C_1-C_2 烷氧基 C_1-C_2 烷基取代；

Y 為 O 、 $C=O$ 或 $S(O)_m$ ，其先決條件係當 Y 為 $C=O$ 時，當 R^4 或 R^5 中任一者為氫時，則 R^6 及 R^7 不同於氫，及當 R^6 或 R^7 中任一者為氫時，則 R^4 及 R^5 不同於氫；

m 為 0 或 1 或 2；

及 G 為氫、鹼金屬陽離子或鹼土金屬陽離子、或選自以下基團的潛伏化基團 (latentating group)： $C(X^a)-R^a$ 及 $C(X^b)-X^c-R^b$ ；

其中 X^a 、 X^b 、及 X^c 為氧；

R^a 為 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基或 C_1-C_4 烷氧基 C_1-C_4 烷基；且

R^b 為 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基或 C_1-C_4 烷氧基 C_1-C_4 烷基；

或式(I)化合物之鹽類 (當 R^2 為未被取代或被取代的

吡唑基、未被取代或被取代的咪唑基(imidazolyl)、或未被取代或被取代的吡啶基時)。

2.根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R^1 為鹵素、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 烯基或 C_2-C_4 炔基。

3.根據申請專利範圍第 1 或 2 項之化合物，其中 R^2 為苯基或吡啶基；或被鹵素、硝基、氰基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基或 C_1-C_2 鹵烷氧基取代之苯基或吡啶基二者。

4.根據申請專利範圍第 3 項之化合物，其中 R^2 為在對位位置上被鹵素取代之苯基，且視需要被鹵素、硝基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基或 C_1-C_2 鹵烷氧基進一步取代。

5.根據申請專利範圍第 4 項之化合物，其中 R^2 為在對位位置上被氯取代之苯基，且視需要被鹵素、硝基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基或 C_1-C_2 鹵烷氧基進一步取代。

6.根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 彼此獨立為氫、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基或 C_1-C_2 烷氧基- C_1-C_2 烷基。

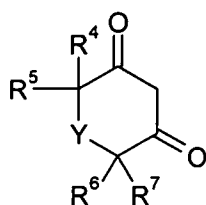
7.根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 Y 為 O、S 或 C=O。

8.根據申請專利範圍第 7 項之化合物，其中 Y 為 O。

9.根據申請專利範圍第 1、2、6 或 7 項中任一項之化合物，其中 G 為氫。

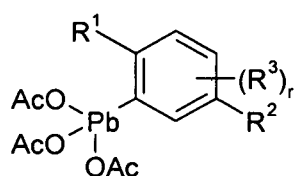
10. 根據申請專利範圍第 1、2、6 或 7 項中任一項之化合物，其中 R^1 為 C_1 - C_4 烷基， R^2 為苯基或被鹵素或 C_1 - C_2 烷基取代之苯基， R^3 為氫 (r 為 0)， R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 彼此獨立為 C_1 - C_2 烷基， Y 為 O 及 G 為氫。

11. 一種用於製備根據申請專利範圍第 1 項之式 (I) 化合物的方法，其中 G 為氫，該方法包含將式 (J) 化合物



式(J)

其中 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 及 Y 具有申請專利範圍第 1 項中派予彼等的意義，與式 (K) 之三乙酸芳基鉛

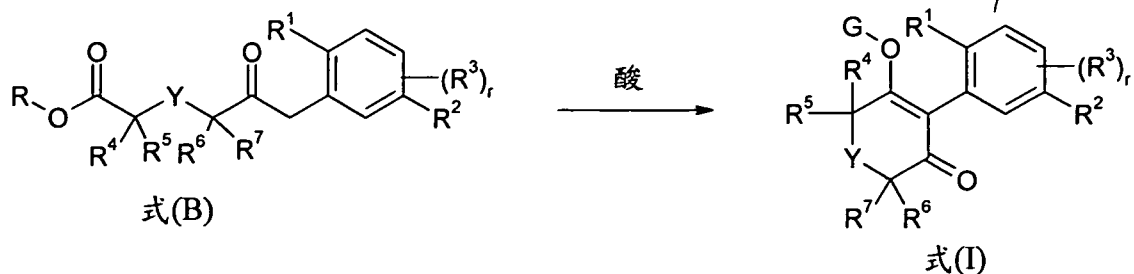


式(K)

其中 R^1 、 R^2 及 R^3 具有申請專利範圍第 1 項中派予彼等的意義，在含氮之配位基存在下反應。

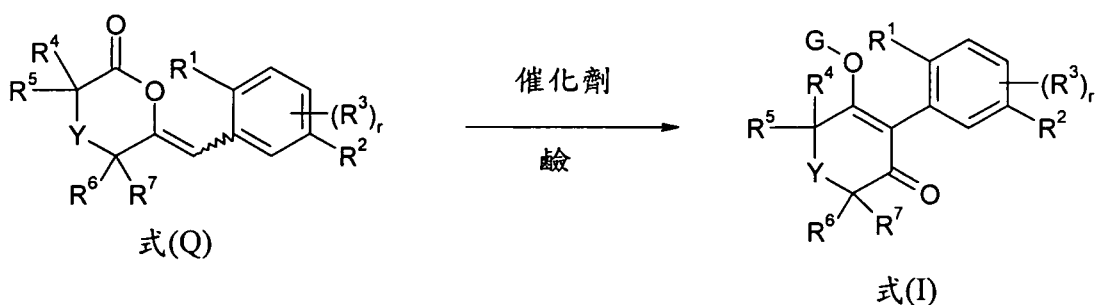
12. 一種用於製備根據申請專利範圍第 1 項之式 (I) 化合物的方法，其中 G 為氫，該方法包含將式 (B) 化合物在酸性條件下環化，

102 年 8 月 9 日替換頁



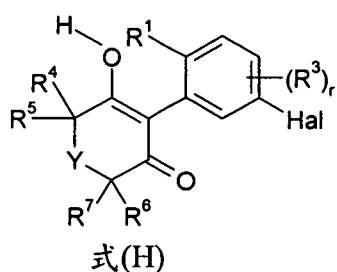
其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 及 Y 具有申請專利範圍第 1 項中派予彼等的意義及 R 為氫。

13. 一種用於製備根據申請專利範圍第 1 項之式 (I) 化合物的方法，其中 G 為氫，該方法包含將式 (Q) 化合物在鹼的存在下及在催化劑的存在下重排，



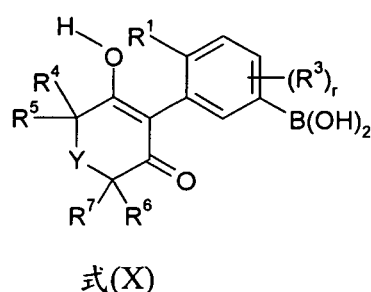
其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 及 r 具有申請專利範圍第 1 項中派予彼等的意義。

14. 一種用於製備根據申請專利範圍第 1 項之式 (I) 化合物的方法，該方法包含將式 (H) 化合物



其中 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 及 r 具有申請專利範圍第 1 項中派予彼等的意義及 Hal 為氯、溴、碘或三氟甲磺醯氧基，與式 $R^2B(OH)_2$ 之芳基-或雜芳基硼酸，其中 R^2 具有申請專利範圍第 1 項中派予其的意義，或其鹽或酯，在適合的鈀催化劑、配位基與鹼的存在下，及在適合的溶劑中反應。

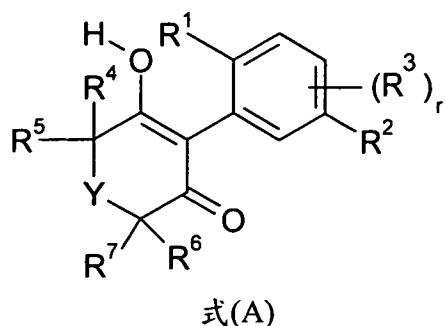
15. 一種用於製備根據申請專利範圍第 1 項之式 (I) 化合物的方法，該方法包含將式 (X) 之芳基硼酸



其中 R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 Y 及 r 具有申請專利範圍第 1 項中派予彼等的意義，或其鹽或酯，與式 R^2-Hal 之化合物，其中 R^2 具有申請專利範圍第 1 項中派予其的意義，及 Hal 為氯、溴、碘或三氟甲磺醯氧基，在適合的鈀催化劑、配位基與鹼的存在下，及在適合的溶劑中反應。

16. 一種用於製備根據申請專利範圍第 1 項之式 (I) 化合物的方法，其中 G 為 $C(X^a)-R^a$ 或 $C(X^b)-X^c-R^b$ ，其中 X^a 、 X^b 及 X^c 為氧， R^a 為 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基或 C_1-C_4 烷氧基 C_1-C_4 烷基，及 R^b 為

C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 烯基、C₃-C₆ 炔基、C₃-C₆ 環烷基或 C₁-C₄ 烷氧基 C₁-C₄ 烷基，該方法包含將式(A)化合物



在或不在至少 1 當量鹼的存在下以鹼化劑處理。

17.一種控制在有用植物之農作物中的禾草及雜草之方法，其包含將除草有效量之如申請專利範圍第 1、2、6 或 7 項中任一項所定義之式 (I) 化合物或含有該等化合物之組成物施予植物或其所在地。

18.根據申請專利範圍第 17 項之方法，其中包含式(I) 化合物之組成物係用於選擇性控制在稻米中的禾草及雜草。

19.一種除草組成物，其除了包含調配佐劑之外，還包含除草有效量之如申請專利範圍第 1、2、6 或 7 項中任一項所定義之式 I 化合物。

20.根據申請專利範圍第 19 項之除草組成物，其除了包含式 I 化合物之外，還包含另外的除草劑作為混合伙伴。

21.根據申請專利範圍第 19 項之除草組成物，其除了包含式 I 化合物之外，還包含安全劑 (safener)。

22.根據申請專利範圍第 19 項之除草組成物，其除了包含式 I 化合物之外，還包含另外的除草劑作為混合伙伴及安全劑。

23.一種混合物，其包含如申請專利範圍第 1、2、6 或 7 項中任一項所定義之式 (I) 化合物，與其他的除草劑組合，其中該混合物係選自下列式 (I) 化合物之混合物中之一：

式 I 化合物 + 乙草胺 (acetochlor)、式 I 化合物 + 三氟羧草醚 (acifluorfen)、式 I 化合物 + 三氟羧草醚-鈉、式 I 化合物 + 苯草醚 (aclonifen)、式 I 化合物 + 丙烯醛 (acrolein)、式 I 化合物 + 拉草 (alachlor)、式 I 化合物 + 枯殺達 (alloxydim)、式 I 化合物 + 烯丙醇、式 I 化合物 + 草殺淨 (ametryn)、式 I 化合物 + 胺唑草酮 (amicarbazone)、式 I 化合物 + 磺胺磺隆 (amidosulfuron)、式 I 化合物 + 二氯胺基吡啶酸 (aminopyralid)、式 I 化合物 + 阿米托 (amitrole)、式 I 化合物 + 胺基磺酸銨、式 I 化合物 + 莎稗磷 (anilofos)、式 I 化合物 + 亞速爛 (asulam)、式 I 化合物 + 草脫淨 (atrazine)、式 I 化合物 + 艾維激素 (aviglycine)、式 I 化合物 + 草芬定 (azafenidin)、式 I 化合物 + 阿日姆沙風 (azimsulfuron)、式 I 化合物 + 畢氟布它密德 (beflubutamid)、式 I 化合物 + 草除靈 (benazolin)、式 I 化合物 + 倍卡貝容 (bencarbazone)、式 I 化合物 + 倍尼芬 (benfluralin)、式 I 化合物 + 倍氟沙特 (benfuresate)、式 I 化合物 + 免速隆 (bensulfuron)、

式 I 化合物 + 免速隆 - 甲基、式 I 化合物 + 地散磷 (bensulide)、式 I 化合物 + 滅草松 (bentazone)、式 I 化合物 + 雙苯嘧草酮 (benzfendizone)、式 I 化合物 + 倍柔畢塞隆 (benzobicyclon)、式 I 化合物 + 倍柔分奈普 (benzofenap)、式 I 化合物 + 必芬諾 (bifenox)、式 I 化合物 + 雙丙胺磷 (bilanafos)、式 I 化合物 + 雙草醚 (bispyribac)、式 I 化合物 + 雙草醚 - 鈉、式 I 化合物 + 硼砂 (borax)、式 I 化合物 + 克草 (bromacil)、式 I 化合物 + 溴丁草胺 (bromobutide)、式 I 化合物 + 溴分諾希姆 (bromofenoxim)、式 I 化合物 + 溴苯亞硝酸鹽 (bromoxynil)、式 I 化合物 + 丁基拉草 (butachlor)、式 I 化合物 + 布它分奈希爾 (butafenacil)、式 I 化合物 + 布它密服斯 (butamifos)、式 I 化合物 + 丁樂靈 (butralin)、式 I 化合物 + 布托西定 (butoxydim)、式 I 化合物 + 丁草特 (butylate)、式 I 化合物 + 二甲基膦酸 (cacodylic acid)、式 I 化合物 + 氯酸鈣、式 I 化合物 + 凱分司托爾 (cafenstrole)、式 I 化合物 + 雙鹽草胺 (carbetamide)、式 I 化合物 + 克繁草 (carfentrazone)、式 I 化合物 + 克繁草 - 乙基、式 I 化合物 + 整形醇 (chlorflurenol)、式 I 化合物 + 整形醇 - 甲基、式 I 化合物 + 克洛達柔 (chloridazon)、式 I 化合物 + 氯嘧磺隆 (chlorimuron)、式 I 化合物 + 氯嘧磺隆 - 乙基、式 I 化合物 + 氯基乙酸、式 I 化合物 + 綠麥隆 (chlorotoluron)、式 I 化合物 + 氯苯胺靈 (chlorpropham)、式 I 化合物 + 綠磺隆 (chlorsulfuron)、式 I 化合物 + 二甲

基氯酞酸 (chlorthal)、式 I 化合物 + 二甲基氯酞酸-二甲基、式 I 化合物 + 吲哚酮草酯 (cinidon)-乙基、式 I 化合物 + 環庚草醚 (cinmethylin)、式 I 化合物 + 西速隆 (cinosulfuron)、式 I 化合物 + 咯草隆 (cisanilide)、式 I 化合物 + 剋草同 (clethodim)、式 I 化合物 + 可洛丁那福普 (clodinafop)、式 I 化合物 + 可洛丁那福普-丙炔基、式 I 化合物 + 異惡草酮 (Clomazone)、式 I 化合物 + 克普草 (clomeprop)、式 I 化合物 + 畢克草 (clopyralid)、式 I 化合物 + 可洛拉蘇蘭 (cloransulam)、式 I 化合物 + 可洛拉蘇蘭-甲基、式 I 化合物 + 甲酚、式 I 化合物 + 庫密路若 (cumyluron)、式 I 化合物 + 氰胺 (cyanamide)、式 I 化合物 + 氰乃淨 (cyanazine)、式 I 化合物 + 環草特 (cycloate)、式 I 化合物 + 環丙嘧磺隆 (cyclosulfamuron)、式 I 化合物 + 環殺草 (cycloxydim)、式 I 化合物 + 賽伏草 (cyhalofop)、式 I 化合物 + 賽伏草-丁基、式 I 化合物 + 殺草隆 (daimuron)、式 I 化合物 + 得拉本 (dalapon)、式 I 化合物 + 邁隆 (dazomet)、式 I 化合物 + 甜菜安 (desmedipham)、式 I 化合物 + 狄斯密退恩 (desmetryn)、式 I 化合物 + 殺草畏 (dicamba)、式 I 化合物 + 二氯苯晴 (dichlobenil)、式 I 化合物 + 鄰-二氯苯、式 I 化合物 + 對-二氯苯、式 I 化合物 + 滴丙酸 (dichlorprop)、式 I 化合物 + 滴丙酸-P、式 I 化合物 + 禾草靈 (diclofop)、式 I 化合物 + 禾草靈-甲基、式 I 化合物 + 雙氯磺草胺 (diclosulam)、式 I 化合物 + 野燕枯 (difenzoquat)、式 I 化合物 + 甲硫野

燕枯 (difenzoquat metilsulfate)、式 I 化合物 + 毗吡草胺 (diflufenican)、式 I 化合物 + 狄氟陸分柔皮 (diflufenzopyr)、式 I 化合物 + 惡唑隆 (dimefuron)、式 I 化合物 + 哌草丹 (dimepiperate)、式 I 化合物 + 狄麥賽可樂 (dimethachlor)、式 I 化合物 + 狄麥賽密退恩 (dimethametryn)、式 I 化合物 + 汰草滅 (dimethenamid)、式 I 化合物 + 汰草滅-P、式 I 化合物 + 穫萎得 (dimethipin)、式 I 化合物 + 二甲基肼酸、式 I 化合物 + 捷乃安 (dinitramine)、式 I 化合物 + 狄諾特伯 (dinoterb)、式 I 化合物 + 大芬滅 (diphenamid)、式 I 化合物 + 異丙淨 (dipropetryn)、式 I 化合物 + 敵草快 (diquat)、式 I 化合物 + 敵草快二溴化物、式 I 化合物 + 汰硫草 (dithiopyr)、式 I 化合物 + 達有龍 (diuron)、式 I 化合物 + 草多索 (endothal)、式 I 化合物 + 抑死夫 (esprocarb)、式 I 化合物 + 伊賽氟拉林 (ethalfluralin)、式 I 化合物 + 胺苯磺隆 (ethametsulfuron)、式 I 化合物 + 胺苯磺隆-甲基、式 I 化合物 + 益收生長素 (ethephon)、式 I 化合物 + 益覆滅 (ethofumesate)、式 I 化合物 + 氯氟苯醚 (ethoxyfen)、式 I 化合物 + 亞速隆 (ethoxysulfuron)、式 I 化合物 + 伊托班尚尼德 (etobenzanid)、式 I 化合物 + 芬殺草 (fenoxaprop)-P、式 I 化合物 + 芬殺草-P-乙基、式 I 化合物 + 四唑草胺 (fentrazamide)、式 I 化合物 + 硫酸亞鐵、式 I 化合物 + 氟燕靈 (flamprop)-M、式 I 化合物 + 伏速隆 (flazasulfuron)、式 I 化合物 + 麥喜為 (florasulam)、式

I 化合物 + 伏寄普 (fluazifop)、式 I 化合物 + 伏寄普-丁基、式 I 化合物 + 伏寄普-P、式 I 化合物 + 伏寄普-P-丁基、式 I 化合物 + 異丙吡草酯 (fluazolate)、式 I 化合物 + 氟酮磺隆 (flucarbazone)、式 I 化合物 + 氟酮磺隆-鈉、式 I 化合物 + 氟啶乙磺隆 (flucetosulfuron)、式 I 化合物 + 氟消草 (fluchloralin)、式 I 化合物 + 氟噻草胺 (flufenacet)、式 I 化合物 + 氟噻嗪草酯 (flufenpyr)、式 I 化合物 + 氟噻嗪草酯-乙基、式 I 化合物 + 氟節胺 (flumetralin)、式 I 化合物 + 氟滅索命 (flumetsulam)、式 I 化合物 + 氟米克拉 (flumiclorac)、式 I 化合物 + 氟米克拉-戊基、式 I 化合物 + 氟米沙立 (flumioxazin)、式 I 化合物 + 氟米羅必 (flumipropin)、式 I 化合物 + 伏草隆 (fluometuron)、式 I 化合物 + 氟羅格賴可芬 (fluoroglycofen)、式 I 化合物 + 氟羅格賴可芬-乙基、式 I 化合物 + 氟杉普 (fluoxaprop)、式 I 化合物 + 弗拉頗沙 (flupoxam)、式 I 化合物 + 氟普帕希耳 (flupropacil)、式 I 化合物 + 氟普洛奈特 (fluproanate)、式 I 化合物 + 氟啶嘧磺隆 (flupyrsulfuron)、式 I 化合物 + 氟啶嘧磺隆-甲基-鈉、式 I 化合物 + 茚丁酯 (flurenol)、式 I 化合物 + 氟立得酮 (fluridone)、式 I 化合物 + 氟氯得酮 (flurochloridone)、式 I 化合物 + 氟氯比 (fluroxypyr)、式 I 化合物 + 呋草酮 (flurtamone)、式 I 化合物 + 氟噻乙草酯 (fluthiacet)、式 I 化合物 + 氟噻乙草酯-甲基、式 I 化合物 + 福美沙芬 (fomesafen)、式 I 化合物 + 噻胺磺隆 (foramsulfuron)、式 I 化合物 + 福殺胺

(fosamine)、式 I 化合物 + 固殺草 (glufosinate)、式 I 化合物 + 固殺草-銨、式 I 化合物 + 嘉磷塞 (glyphosate)、式 I 化合物 + 鹵殺福隆 (halosulfuron)、式 I 化合物 + 鹵殺福隆-甲基、式 I 化合物 + 鹵斯弗 (haloxyfop)、式 I 化合物 + 鹵斯弗-P、式 I 化合物 + 環己基二甲胺基甲基三阱二酮 (hexazinone)、式 I 化合物 + 依馬扎沙苯 (imazamethabenz)、式 I 化合物 + 依馬扎沙苯-甲基、式 I 化合物 + 甲氧咪草煙 (imazamox)、式 I 化合物 + 甲咪唑煙酸 (imazapic)、式 I 化合物 + 依滅草 (imazapyr)、式 I 化合物 + 嗎紫奎 (imazaquin)、式 I 化合物 + 嗎茲紫比 (imazethapyr)、式 I 化合物 + 嗎殺福隆 (imazosulfuron)、式 I 化合物 + 節草酮 (indanofan)、式 I 化合物 + 碘基甲烷、式 I 化合物 + 碘甲磺隆 (iodosulfuron)、式 I 化合物 + 碘甲磺隆-甲基-鈉、式 I 化合物 + 碘苯亞硝酸鹽 (ioxynil)、式 I 化合物 + 異丙土隆 (isoproturon)、式 I 化合物 + 依索隆 (isouron)、式 I 化合物 + 依索苯 (isoxaben)、式 I 化合物 + 異𪔐𪔐托 (isoxachlortole)、式 I 化合物 + 異𪔐𪔐草 (isoxaflutole)、式 I 化合物 + 依索比立福 (isoxapyrifop)、式 I 化合物 + 卡靈草 (karbutilate)、式 I 化合物 + 累托芬 (lactofen)、式 I 化合物 + 環草定 (lenacil)、式 I 化合物 + 利倫 (linuron)、式 I 化合物 + 甲氯丙酸 (mecoprop)、式 I 化合物 + 甲氯丙酸-P、式 I 化合物 + 美芬司特 (mefenacet)、式 I 化合物 + 氟草磺 (mefluidide)、式 I 化合物 + 磺胺磺隆 (mesosulfuron)、式 I 化合物 + 磺胺磺

隆-甲基、式 I 化合物 + 甲基磺草酮 (mesotrione)、式 I 化合物 + 米塔姆 (metam)、式 I 化合物 + 噁唑醚草胺 (metamifop)、式 I 化合物 + 滅得群 (metamitron)、式 I 化合物 + 美他佐克羅 (metazachlor)、式 I 化合物 + 甲基苯噻隆 (methabenzthiazuron)、式 I 化合物 + 滅草唑 (methazole)、式 I 化合物 + 甲基膦酸、式 I 化合物 + 甲基代隆 (methyldymron)、式 I 化合物 + 異硫代氰酸甲酯、式 I 化合物 + 美他苯隆 (metobenzuron)、式 I 化合物 + 秀谷隆 (metobromuron)、式 I 化合物 + 美托克羅 (metolachlor)、式 I 化合物 + S-美托克羅、式 I 化合物 + 美托沙泣 (metosulam)、式 I 化合物 + 美托斯隆 (metoxuron)、式 I 化合物 + 賽克津 (metribuzin)、式 I 化合物 + 美殺福隆 (metsulfuron)、式 I 化合物 + 美殺福隆-甲基、式 I 化合物 + 莫立那特 (molinate)、式 I 化合物 + 單利倫 (monolinuron)、式 I 化合物 + 那普苯胺 (naproanilide)、式 I 化合物 + 那普醯胺 (napropamide)、式 I 化合物 + 抑草生 (naptalam)、式 I 化合物 + 草不隆 (neburon)、式 I 化合物 + 尼可殺福隆 (nicosulfuron)、式 I 化合物 + 尼比拉西芬 (nipyracllophen)、式 I 化合物 + 正-甲基嘉磷塞、式 I 化合物 + 壬酸、式 I 化合物 + 達草滅 (norflurazon)、式 I 化合物 + 油酸 (脂肪酸)、式 I 化合物 + 奧貝卡 (orbencarb)、式 I 化合物 + 歐索磺目洛 (orthosulfamuron)、式 I 化合物 + 黃草消 (oryzalin)、式 I 化合物 + 奧沙地奇 (oxadiargyl)、式 I 化合物 + 惡草

靈 (oxadiazon)、式 I 化合物 + 環氧嘧磺隆 (oxasulfuron)、
式 I 化合物 + 噁嗪草酮 (oxaziclomefone)、式 I 化合物 +
奧氟芬 (oxyfluorfen)、式 I 化合物 + 巴拉刈 (paraquat)、
式 I 化合物 + 巴拉刈二氯化物、式 I 化合物 + 克草敵
(pebulate)、式 I 化合物 + 培那西林 (pendimethalin)、
式 I 化合物 + 磺蘆脲 (penoxsulam)、式 I 化合物 + 五氯酚、
式 I 化合物 + 甲氯草胺 (pentanochlor)、式 I 化合物 + 環
戊噁草酮 (pentoxazone)、式 I 化合物 + 烯草胺
(pethoxamid)、式 I 化合物 + 石油、式 I 化合物 + 甜菜寧
(phenmedipham)、式 I 化合物 + 甜菜寧-乙基、式 I 化
合物 + 毒莠定 (picloram)、式 I 化合物 + 吡氟酰草胺
(picolinafen)、式 I 化合物 + 吡諾山登 (pinoxaden)、式
I 化合物 + 派羅福 (piperophos)、式 I 化合物 + 亞肼酸鉀、
式 I 化合物 + 疊氮化鉀、式 I 化合物 + 普立拉克
(pretilachlor)、式 I 化合物 + 撲滅磺甲酯 (primisulfuron)、
式 I 化合物 + 撲滅磺甲酯-甲基、式 I 化合物 + 普魯二胺
(prodiamine)、式 I 化合物 + 普氟唑 (profluazol)、式 I
化合物 + 環苯草酮 (profoxydim)、式 I 化合物 + 調環酸
(prohexadione)-鈣、式 I 化合物 + 撲滅通 (prometon)、
式 I 化合物 + 撲草淨 (prometryn)、式 I 化合物 + 毒草安
(propachlor)、式 I 化合物 + 敵稗 (propanil)、式 I 化
合物 + 西帕奎 (propaquizafop)、式 I 化合物 + 撲滅津
(propazine)、式 I 化合物 + 苯胺靈 (propham)、式 I 化
合物 + 普羅比索克 (propisochlor)、式 I 化合物 + 丙苯磺

隆 (propoxycarbazone)、式 I 化合物 + 丙苯磺隆-鈉、式 I 化合物 + 氯甲丙炔基苯甲醯胺 (propyzamide)、式 I 化合物 + 撲沙福卡 (prosulfocarb)、式 I 化合物 + 撲沙殺福隆 (prosulfuron)、式 I 化合物 + 雙唑草腈 (pyraclonil)、式 I 化合物 + 吡草醚 (pyraflufen)、式 I 化合物 + 吡草醚-乙基、式 I 化合物 + 吡拉蘇福托 (pyrasulfotole)、式 I 化合物 + 吡唑林特 (pyrazolynate)、式 I 化合物 + 必拉若殺福隆 (pyrazosulfuron)、式 I 化合物 + 必拉若殺福隆-乙基、式 I 化合物 + 比拉若西芬 (pyrazoxyfen)、式 I 化合物 + 嘧啶肟草醚 (pyribenzoxim)、式 I 化合物 + 稗草畏 (pyributicarb)、式 I 化合物 + 吡達夫醇 (pyridafol)、式 I 化合物 + 吡達特 (pyridate)、式 I 化合物 + 環酯草醚 (pyriftalid)、式 I 化合物 + 吡嘧多巴克 (pyriminobac)、式 I 化合物 + 吡嘧多巴克-甲基、式 I 化合物 + 吡嘧蘇發 (pyrimisulfan)、式 I 化合物 + 比立塞巴克 (pyrithiobac)、式 I 化合物 + 比立塞巴克-鈉、式 I 化合物 + 吡洛山蘇風 (pyroxasulfone) (KIH-485)、式 I 化合物 + 吡洛殊蘭 (pyroxulam)、式 I 化合物 + 昆多拉克 (quinclorac)、式 I 化合物 + 昆美拉克 (quinmerac)、式 I 化合物 + 滅藻 (quinoclamine)、式 I 化合物 + 奎拉弗 (quizalofop)、式 I 化合物 + 奎拉弗-P、式 I 化合物 + 力殺福隆 (rimsulfuron)、式 I 化合物 + 稀禾定 (sethoxydim)、式 I 化合物 + 環草隆 (siduron)、式 I 化合物 + 西瑪三唑 (simazine)、式 I 化合物 + 西草淨 (simetryn)、式 I 化合物 + 亞肼酸鈉、式 I

化合物 + 疊氮化鈉、式 I 化合物 + 氯酸鈉、式 I 化合物 + 磺草酮 (sulcotrione)、式 I 化合物 + 沙芬曲諾 (sulfentrazone)、式 I 化合物 + 殺福美隆 (sulfometuron)、式 I 化合物 + 殺福美隆-甲基、式 I 化合物 + 沙弗司特 (sulfosate)、式 I 化合物 + 磺醢磺隆 (sulfosulfuron)、式 I 化合物 + 硫酸、式 I 化合物 + 焦油、式 I 化合物 + 替布他 (tebutam)、式 I 化合物 + 替布塞隆 (tebuthiuron)、式 I 化合物 + 替呋退酮 (tefuryltrione)、式 I 化合物 + 提波退酮 (tembotrione)、式 I 化合物 + 得殺草 (tepraloxydim)、式 I 化合物 + 特草定 (terbacil)、式 I 化合物 + 甲氧去草淨 (terbumeton)、式 I 化合物 + 特丁津 (terbuthylazine)、式 I 化合物 + 去草淨 (terbutryn)、式 I 化合物 + 西尼克羅 (thenylchlor)、式 I 化合物 + 噻殺福隆 (thiazafluron)、式 I 化合物 + 噻諾比 (thiazopyr)、式 I 化合物 + 噻吩殺福隆 (thifensulfuron)、式 I 化合物 + 噻卡倍容 (thiencarbazon)、式 I 化合物 + 噻吩殺福隆-甲基、式 I 化合物 + 噻歐苯卡 (thiobencarb)、式 I 化合物 + 替歐卡巴力 (tiocarbazil)、式 I 化合物 + 托普米容 (topramezone)、式 I 化合物 + 曲考昔地 (tralkoxydim)、式 I 化合物 + 野麥畏 (tri-allate)、式 I 化合物 + 三阿蘇殺福隆 (triasulfuron)、式 I 化合物 + 三吡氟草胺 (triaziflam)、式 I 化合物 + 三苯那隆 (tribenuron)、式 I 化合物 + 三苯那隆-甲基、式 I 化合物 + 殺草畏 (tricamba)、式 I 化合物 + 定草酯 (triclopyr)、式 I 化合物 + 草達津 (trietazine)、式 I 化合物 + 三氟氧殺福隆

(trifloxysulfuron)、式 I 化合物 + 三氟氧殺福隆-鈉、式 I 化合物 + 氟樂靈 (trifluralin)、式 I 化合物 + 三氟殺福隆 (triflusulfuron)、式 I 化合物 + 三氟殺福隆-甲基、式 I 化合物 + 三羥基三吡、式 I 化合物 + 抗倒酯 (trinexapac) - 乙基、式 I 化合物 + 三氟甲磺隆 (tritosulfuron)、式 I 化合物 + [3-[2-氯基-4-氯基-5-(1-甲基-6-三氟甲基-2,4-二酮(dioxo)-1,2,3,4-四氫嘧啶-3-基)苯氧基]-2-吡啶氧基]乙酸乙酯、式 I 化合物 + 4-羥基-3-[[2-[(2-甲氧基乙氧基)甲基]-6-(三氟甲基)-3-吡啶基]羰基]雙環[3.2.1]辛-3-烯-2-酮、式 I 化合物 + 2-氯基-5-[3,6-二氫-3-甲基-2,6-二酮-4-(三氟甲基)-1(2H)-嘧啶基]-4-氯基-N-[[甲基(1-甲基乙基)胺基]磺醯基]苯甲醯胺及式 I 化合物 + 4-羥基-3-[[2-(3-甲氧基丙基)-6-(二氟甲基)-3-吡啶基]羰基]雙環[3.2.1]辛-3-烯-2-酮。

十一、圖式：

無