參、發明人：(共 3 人)

姓　名：(中文/英文)

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

住居所地址：(中文/英文)

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

國　籍：(中文/英文)

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

肆、聲明事項：

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

☑ **本案申請前已向下列國家（地區）申請專利：**

1.英國；2002年08月22日；0219612.9

2.英國；2003年05月07日；0310464.3

3.

4.

5.

☑ **主張國際優先權(專利法第二十四條)：**

【格式請依：受理國家（地區）；申請日；申請案號數 順序註記】

1.英國；2002年08月22日；0219612.9

2.英國；2003年05月07日；0310464.3

3.

4.

5.

☐ **主張國內優先權(專利法第二十五條之一)：**

【格式請依：申請日；申請案號數 順序註記】

1.

2.

☐ **主張專利法第二十六條微生物：**

☐ 國內微生物 【格式請依：寄存機構；日期；號碼 順序註記】

☐ 國外微生物 【格式請依：寄存國名；機構；日期；號碼 順序註記】

☐ 熟習該項技術者易於獲得，不須寄存。

玖、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於具有微生物活性，尤其是殺黴菌活性之新穎1,2,3-三唑衍生物。本發明亦關於製備此等化合物所用之新穎中間物，包括至少一種新穎化合物作為活性成分之農業化學組合物，及活性成分或組合物在農業或園藝上用作控制或預防農作物受植物病蟲害微生物，尤其是真菌侵害之用途。

【先前技術】

本發明發現式(I)之新穎化合物實務上具有極有利之活性圖譜，以對抗因真菌以及細菌與濾過性病毒造成之疾病。

式(I)化合物可用於農業區域及用作活性成分以控制植物昆蟲之相關領域。新穎之化合物係以低之使用率下極佳之活性，且可為植物可忍受及在環境上安全下區分。其具有及有用之治療、預防及系統性質，且可用於保護許多耕種之植物。式(I)之化合物可用於抑制或破壞在有用作物之不同穀物枝植物或植物之部分(水果、花、葉、莖、塊莖、根部)上產生之害蟲，且亦可保護後來生長之植物部分，例如由植物病蟲害之微生物部分。

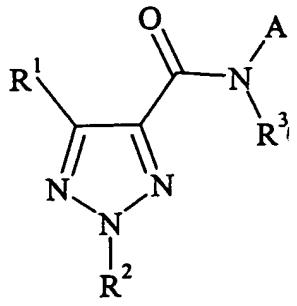
亦可使用式(I)之化合物當作處理作物繁殖材料用之填充劑，尤其是種子(水果、塊莖、穀粒)及切割下之作物(例如稻米)，以保護免於真菌之感染以及免於土壤中造成之植物病蟲害真菌。

另外，本發明之化合物可用於控制相關區域中之真菌，

例如用於技術材料之保護，包含木材及木材相關之技術性產物，用於食品之儲存、衛生管理等。

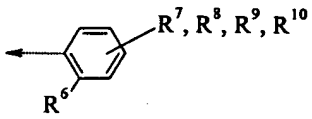
【發明內容】

本發明係提供一種下式(I)之化合物：

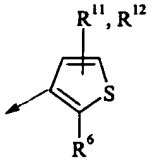


(I)

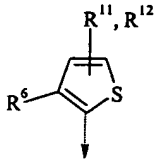
其中A為選自式(A1)至(A22)之鄰-取代之環；



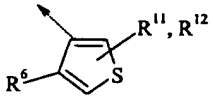
(A1)



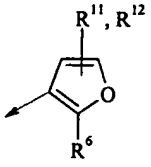
(A2)



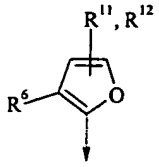
(A3)



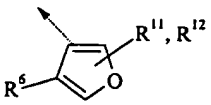
(A4)



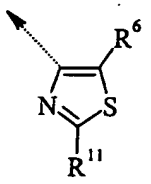
(A5)



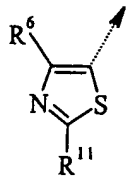
(A6)



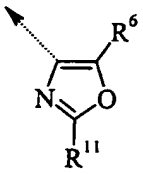
(A7)



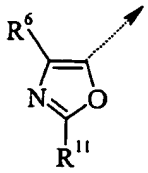
(A8)



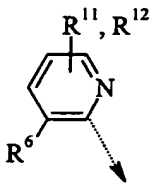
(A9)



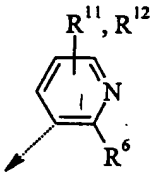
(A10)



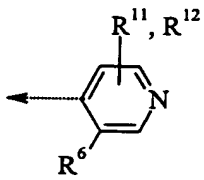
(A11)



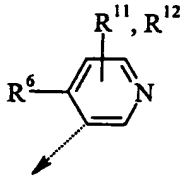
(A12)



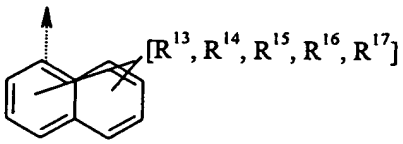
(A13)



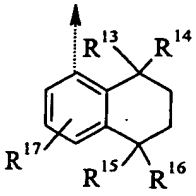
(A14)



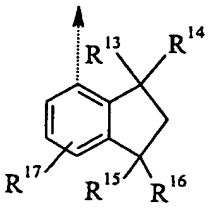
(A15)



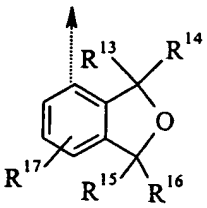
(A16)



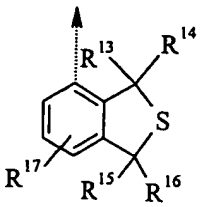
(A17)



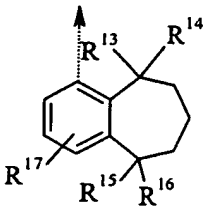
(A18)



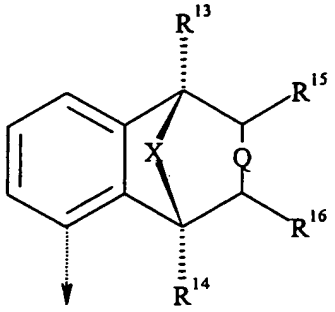
(A19)



(A20)



(A21)



(A22)

Q為單鍵或雙鍵；X為O、N(R^{18})、S或($CR^{19}R^{20}$)($CR^{21}R^{22}$)$_m$($CR^{23}R^{24}$)$_n$；R^1為鹵素、氰基、硝基、C_{1-4}-烷基、C_{1-4}鹵烷基、C_{1-4}烷氧基或C_{1-4}鹵烷氧基，或視情況取代之C_{2-4}烯基，視情況取代之C_{2-4}炔基或視情況取代之SO_2(C_{1-4})烷基(其中視情況取代之基團各具有至多3個取代基，且各獨立選自鹵素及C_{1-4}烷氧基)；R^2為C_{1-4}烷基、C_{1-4}鹵烷基、C_{1-4}烷氧基(C_{1-4})烷基或C_{1-4}烷基硫基(C_{1-4})烷基或[視情況取代之芳基](C_{1-4})烷基-或[視情況取代之芳基]氧基(C_{1-4})烷基-(其中視情況取代之芳基基團各具有至多3個取代基，且各獨立選自鹵素及C_{1-4}烷氧基)；R^3為氫、$CH_2C{\equiv}CR^4$、$CH_2CR^4{=}C(H)R^4$、$CH{=}C{=}CH_2$或COR^5，或視情況取代之C_{1-4}烷基，視情況取代之C_{1-4}烷氧基或視情況取代之(C_{1-4})烷基C(=O)O (其中視情況取代之基團各具有至多3個取代基，且各獨立選自鹵素及C_{1-4}烷氧基、C_{1-4}烷基、C_{1-2}鹵烷氧基、羥基、氰基、羧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、甲基磺醯基及乙基磺醯基)；各R^4係獨立為氫、鹵素、C_{1-4}烷基、C_{1-4}鹵烷基、C_{1-4}烷氧基、或C_{1-4}烷氧基(C_{1-4})烷基；R^5為氫或視情況取代之C_{1-6}烷基、視情況取代之C_{1-4}烷氧基、視情況取代之C_{1-4}烷氧基(C_{1-4})

烷基、視情況取代之C_{1-4}烷基硫基(C_{1-4})烷基或視情況取代之芳基(其中視情況取代之基團各具有至多3個取代基，且各獨立選自鹵素、C_{1-6}烷氧基、C_{1-6}鹵烷氧基、氰基、羥基、甲氧基羰基及乙氧基羰基)；R^6為苯基[視情況以至多3個取代基取代，且各獨立選自鹵素、氰基、硝基、C_{1-4}烷基、C_{1-4}鹵烷基、C_{1-4}烷氧基、C_{1-4}鹵烷氧基、C_{1-4}鹵烷基硫基、C(H)=N-OH、C(H)=N-O(C_{1-6}烷基)、C(C_{1-6}烷基)=N-OH、C(C_{1-6}烷基)=N-O-(C_{1-6}-烷基)、$(Z)_pC \equiv CR^{25}$及$(Z)_pCR^{28}=CR^{26}R^{27}$]，5-6員雜環[其中該環含有1至3個雜原子，(各獨立選自氧、硫及氮)，且該環視情況以至多3個取代基取代，各取代基均獨立選自鹵素、氰基、硝基、C_{1-4}烷基、C_{1-4}鹵烷基、C_{1-4}烷氧基、C_{1-4}鹵烷氧基、C(H)=N-O-(C_{1-6}烷基)及C(C_{1-6}烷基)=N-O-(C_{1-6}-烷基)]，C_{3-12}烷基[視情況以至多6個取代基取代，各個均獨立選自鹵素、氰基、C_{1-4}烷氧基、C_{1-4}硫基烷基、COO-C_{1-4}烷基、=N-OH、=N-O-(C_{1-4}烷基)，C_{3-8}環烷基(本身視情況以至多3個取代基取代，各個均獨立選自C_{1-4}烷基、鹵素、C_{1-4}烷氧基及C_{1-4}鹵烷氧基)，及C_{4-8}環烯基(本身視情況以至多3個取代基取代，各個均獨立選自C_{1-4}烷基、鹵素、C_{1-4}烷氧基及C_{1-4}鹵烷氧基)]，C_{2-12}烯基[視情況以至多6個取代基取代，各個均獨立選自鹵素、氰基、C_{1-4}烷氧基、C_{1-4}硫基烷基、COO-(C_{1-4}烷基)、=N-OH、=N-O-(C_{1-4}烷基)，C_{3-8}環烷基(本身視情況以至多3個取代基取代，各個均獨立選自C_{1-4}烷基、鹵素、C_{1-4}烷氧基及C_{1-4}鹵烷氧基)，及C_{4-8}環烯基(本身視情況以至多3個取代基取代，各個均

獨立選自C_{1-4}烷基、鹵素、C_{1-4}烷氧基及C_{1-4}鹵烷氧基)]，C_{2-12}炔基[視情況以至多6個取代基取代，各個均獨立選自鹵素、氰基、C_{1-4}烷氧基、C_{1-4}硫基烷基、COO-C_{1-4}烷基、=N-OH、=N-O-(C_{1-4}烷基)，C_{3-8}環烷基(本身視情況以至多3個取代基取代，各個均獨立選自C_{1-4}烷基、鹵素、C_{1-4}烷氧基及C_{1-4}鹵烷氧基)，$Si(CH_3)_3$，及C_{4-8}環烯基(本身視情況以至多3個取代基取代，各個均獨立選自C_{1-4}烷基、鹵素、C_{1-4}烷氧基及C_{1-4}鹵烷氧基)]，C_{3-8}環烷基[視情況以至多3個取代基取代，各個均獨立選自鹵素、C_{1-4}烷基、C_{1-4}鹵烷基、C_{1-4}烷氧基、C_{1-4}鹵烷氧基、C_{1-4}硫基烷基、C_{3-8}環烷基(本身視情況以至多3個取代基取代，各個均獨立選自C_{1-4}烷基、鹵素、C_{1-4}烷氧基及C_{1-4}鹵烷氧基)，及苯基(本身視情況以至多五個獨立選擇之鹵素原子取代)]，C_{4-8}環烯基[本身視情況以至多3個取代基取代，各個均獨立選自鹵素、C_{1-4}烷基、C_{1-4}鹵烷基、C_{1-4}烷氧基、C_{1-4}鹵烷氧基、C_{3-6}環烷基(本身視情況以至多3個取代基取代，各個均獨立選自C_{1-4}烷基、鹵素、C_{1-4}烷氧基及C_{1-4}鹵烷氧基)，及苯基(本身視情況以至多五個獨立選擇之鹵素原子取代)]，C_{6-12}雙環烷基[視情況以至多3個取代基取代，各個均獨立選自鹵素、C_{1-4}烷基及C_{1-4}鹵烷基]或脂系、飽和或不飽和基[其中之基含三至十三個碳原子及至少一個矽原子及，視情況含一至三個各獨立選自氧、氮及硫之雜原子，且該基視情況以至多四個獨立選擇之鹵素原子取代]；R^7、R^8、R^9、R^{10}、R^{11}及R^{12}各獨立為氫、鹵素、氰基、硝基、C_{1-4}烷基、C_{1-4}鹵烷基、C_{1-4}烷氧基、C_{1-4}鹵

烷氧基、C_{1-4}硫烷基或C_{1-4}硫鹵烷基；R^{13}、R^{14}、R^{15}、R^{16}及R^{17}各獨立為氫、鹵素、C_{1-4}烷基、$C(O)CH_3$、C_{1-4}鹵烷基、C_{1-4}烷氧基、C_{1-4}鹵烷氧基、C_{1-4}硫烷基、C_{1-4}硫鹵烷基、羥基甲基或C_{1-4}烷氧基甲基；R^{18}為氫、C_{1-4}烷基、C_{1-4}烷氧基(C_{1-4})烷基、甲醯基、$C(=O)C_{1-4}$烷基(視情況以鹵素、C_{1-4}烷氧基取代)或$C(=O)O$-C_{1-6}烷基(視情況以鹵素、C_{1-4}烷氧基或CN取代)；R^{19}、R^{20}、R^{21}、R^{22}、R^{23}及R^{24}各獨立為C_{1-6}烷基、C_{2-6}烯基[二者均視情況以鹵素、羥基、=O、C_{1-4}烷氧基、O-$C(O)$-C_{1-4}烷基、芳基或3-7員碳環(本身視情況以至多三個甲基取代)]，3-7員碳環(本身視情況以至多三個甲基取代，且視情況含一個選自氮及氧之雜原子)、氫、鹵素、羥基或C_{1-4}烷氧基；或$R^{19}R^{20}$與其所附接之碳原子一起形成羰-基，3-5員碳環(視情況以至多三個甲基取代)，C_{1-6}次烷基(視情況以至多三個甲基取代)或C_{3-6}環次烷基(視情況以至多三個甲基取代)；R^{25}為氫、鹵素、C_{1-4}烷基、C_{1-4}鹵烷基、C_{1-4}烷氧基(C_{1-4})烷基、C_{1-4}鹵烷氧基(C_{1-4})烷基或$Si(C_{1-4}$烷基$)_3$；R^{26}及R^{27}各獨立為氫、鹵素、C_{1-4}烷基或C_{1-4}鹵烷基；R^{28}為氫、C_{1-4}烷基或C_{1-4}鹵烷基；m為0或1；n為0或1；p為0或1；且Z為C_{1-4}伸烷基。

鹵素為氟、氯、溴或碘。

【實施方式】

各烷基基團為直鏈或支鏈，且為例如甲基、乙基、正丙基、正丁基、正戊基、正己基、異丙基、第二丁基、異丁基、第三丁基、新-戊基、正庚基、1,3-二甲基丁基、1,3-

二甲基戊基、1-甲基-3-乙基-丁基或1,3,3-三甲基丁基。

鹵烷基基團為以一或多個相同或不同之鹵素原子取代之烷基基團，且為例如CF_3、CF_2Cl、CHF_2、CH_2F、CCl_3、CF_3CH_2、CHF_2CH_2、CH_2FCH_2、CH_3CHF或CH_3CF_2。

烯基及炔基基團可為直鏈或支鏈形式。適當之烯基基團可為(E)-或(Z)-結構。實例為乙烯基、烯丙基、乙炔基及炔丙基。

次烷基基團可為直鏈或支鏈形式。次烷基包含次甲基[CH_2=C]、次乙基[$CH_3C(H)$=C]、正-次丙基、異-次丙基、[$(CH_3)_2C$=C]、正-次丁基、異-次丁基、2-次丁基、正-次戊基、異-次戊基、新-次戊基、2-次戊基、正-次己基、2-次己基、3-次己基、異-次己基、及新-次己基。

環烷基包含環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、及環辛基。

環烯基包含環丁烯基、環戊烯基、環己烯基及環庚烯基。

環戊烷基包含環戊丙基[$c(C_3H_4)$=C]、環次丁基、環次戊基及環次己基。

雙環烷基包含雙環并[1,1,1]戊基、雙環并[2,1,1]己基、雙環并[2,2,1]庚基、雙環并[2,2,2]辛基、雙環并[3,2,1]辛基及雙環并[3,2,2]壬基。

芳基包含苯基、萘基、蒽基、芴基及茚滿基，但較好為苯基。

依本發明之一目的，A定義如上，條件為不為(A1)。

依本發明另一目的，R^6定義如上，條件為不為脂系、飽

和或不飽和基[其中之基含有三至十三個碳原子及至少一個矽原子及視情況之一至三個各獨立選自氧、氮及硫之雜原子，且該基視情況以至多四個獨立選自鹵素原子取代]。

依本發明另一目的，A定義如上，條件為當R^6為脂系、飽和或不飽和基[其中之基包含三至十三個碳原子及至少一個矽原子及視情況之一至三個各獨立選自氧、氮及硫之雜原子，且該基視情況以至多四個獨立選自鹵素原子取代]時，A不為(A1)。

較佳之Q為單鍵。

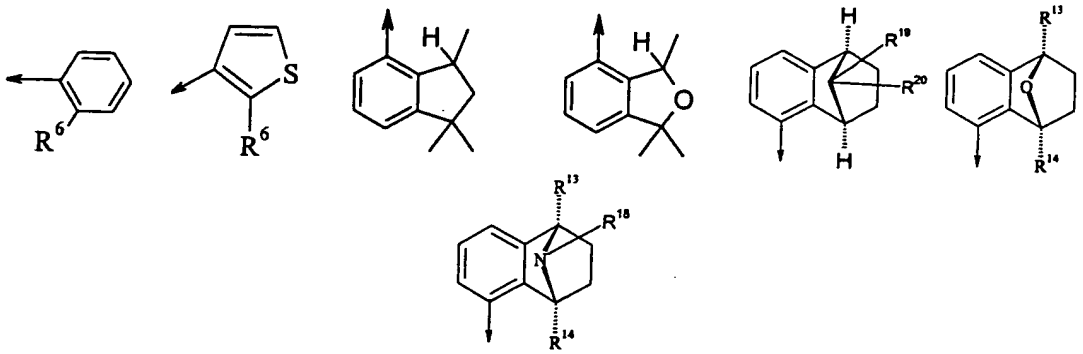
較佳之n為0。

較佳之m為0。

較佳之A係選自(A1)、(A2)、(A3)、(A16)、(A17)、(A18)、(A19)、(A20)及(A22)。

更好A係選自(A1)、(A2)、(A18)、(A19)及(A22)。

又更好A係選自下列鄰-取代環之一：



其中R^{13}及R^{14}各獨立選自H及C_{1-4}烷基。

較好X為O、NR^{18}或$(CR^{19}R^{20})(CR^{21}R^{22})_m(CR^{23}R^{24})_n$。

更好X為O或$(CR^{19}R^{20})(CR^{21}R^{22})_m(CR^{23}R^{24})_n$。

又更好X為$(CR^{19}R^{20})(CR^{21}R^{22})_m(CR^{23}R^{24})_n$。

最好X為$(CR^{19}R^{20})$。

較好R^1為C_{1-4}烷基、C_{1-4}鹵烷基、NO_2、CN或OCF_3。

更好R^1為CHF_2、CF_3、CH_2F、CF_2Cl、CH_3或C_2H_5。

又更好R^1為CHF_2、CF_3、CH_2F、CF_2Cl或CH_3。

最好R^1為CHF_2、CF_3或CH_2F。

較佳之R^2為C_{1-4}烷基、C_{1-4}鹵烷基、C_{1-4}烷氧基(C_{1-4})烷基或C_{1-4}烷基硫基(C_{1-4})烷基。

更好R^2為CH_3、CF_3、C_2H_5、CH_2OCH_3或CH_2SCH_3。

又更好R^2為CH_3或C_2H_5。

最好R^2為CH_3。

較佳之R^3為氫、$CH_2C{\equiv}CR^4$、$CH_2CR^4{=}C(H)R^4$、$CH{=}C{=}CH_2$或COR^5。

更好R^3為H、$CH_2C{\equiv}CH$、$CH{=}C{=}CH_2$、$CH_2CH{=}CH_2$或$COCH_3$。

又更好之R^3為H、$CH_2C{\equiv}CH$、$CH{=}C{=}CH_2$或$CH_2CH{=}CH_2$

再更好之R^3為H、$CH_2C{\equiv}CH$或$CH{=}C{=}CH_2$。

最好R^3為H。

較好各R^4係獨立為H、鹵素、C_{1-4}烷基或C_{1-4}烷氧基。

更好各R^4獨立為H、Cl、Br、CH_3或CH_3O。

又更好各R^4獨立為H、Cl或CH_3。

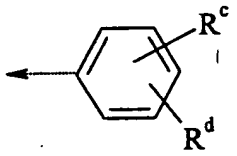
最好告R^4為H。

較好R^5為H、C_{1-6}烷基、C_{1-4}烷氧基或C_{1-4}烷氧基(C_{1-4})烷基。

更好R^5為H、甲基、$OC(CH_3)_3$或CH_2OCH_3。

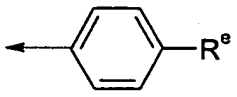
又更好R^5為H或甲基。

較好R^6係選自C_{3-10}烷基、C_{3-9}鹵烷基、C_{3-7}環烷基[視情況以C_3環烷基(本身視情況以C_{1-2}烷基取代)或以至多二個C_{1-4}烷基取代]、脂系基[含有三至十個碳原子及至少一個矽原子，及視情況之一個氧原子]、噻吩基[視情況以鹵基取代]、呋喃基[視情況以鹵基取代]、吡啶基[視情況以鹵基取代]、噁唑基、異噁唑基及



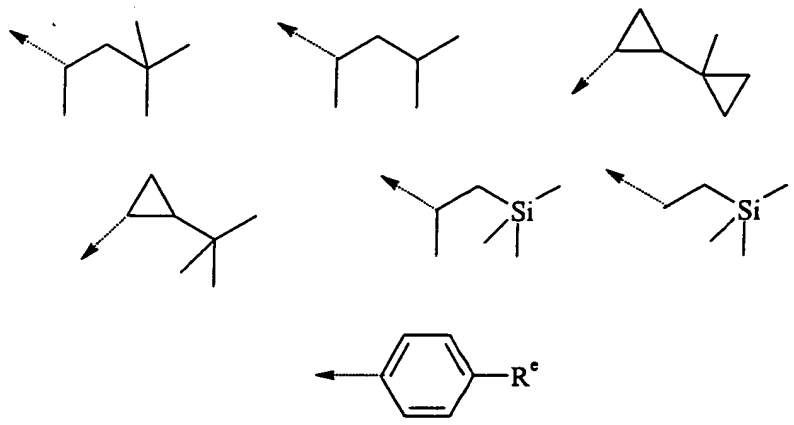
其中R^c及R^d係獨立為H、Cl、Br、F、I、CN、NO_2、C_{1-4}烷基、CF_3、SCF_3、OCF_3、CH=NOH、CH=N-OC_{1-6}烷基、C≡CH、C≡C-$Si(CH_3)_3$、C(H)=CH_2或C(H)=CH(C_{1-4}烷基)。

更好R^6為C_{3-7}烷基、C_{3-6}環烷基[視情況以C_{1-4}烷基或C_3環烷基(本身視情況以C_{1-2}烷基取代)取代]、脂系基(含有三至八個碳原子及至少一個矽原子)或



其中R^e為Cl、Br、F、CF_3、OCF_3、CH=N-OC_{1-4}烷基、C≡CH、C≡C-$Si(CH_3)_3$或C(H)=CH_2[依其一目的較好R^e為Cl、Br、F、CF_3、OCF_3、CH=N-OC_{1-4}烷基、C≡CH或C(H)=CH_2]。

又更好R^6係選自下列基團之一：



其中R^e為Cl、Br、F、CF_3、C≡CH、C≡C-Si$(CH_3)_3$或CH=N-OC_{1-4}烷基[依其一目的較好R^e為Cl、Br、F、CF_3、C≡CH或CH=N-OC_{1-4}烷基]。

較好R^7為H、F或CH_3。

較好R^8為H。

較好R^9為H。

較好R^{10}為H。

較好R^{11}為H。

較好R^{12}為H。

較好R^{13}、R^{14}、R^{15}、R^{16}各獨立選自H、CH_3、C_2H_5、CF_3、CH_3O、$C(O)CH_3$或CH_3OCH_2。

更好R^{13}、R^{14}、R^{15}、R^{16}各獨立為H或CH_3。

較好R^{17}為H。

較好R^{18}為H、CH_3、C_2H_5、$C(O)OC_{1-4}$烷基(視情況以鹵素或C_{1-4}烷氧基取代)或COH。

更好R^{18}為$C(O)OC_{1-4}$烷基(視情況以鹵素或C_{1-4}烷氧基取代)或COH。

又更好R^{18}為C(O)OC_{1-4}烷基(視情況以鹵素或C_{1-4}烷氧基取代)。

最好R^{18}為C(O)OC_{1-4}烷基。

較好R^{19}及R^{20}各獨立為H、鹵素、C_{1-5}烷基、C_{1-3}烷氧基、CH_2O、C_{3-6}環烷基、CH_2O-C(=O)CH_3、CH_2-C_{3-6}環烷基或苄基；或R^{19}及R^{20}與其所附接之碳原子一起形成羰基、3-5員碳環、C_{1-5}次烷基或C_{3-6}環次烷基。

更好R^{19}及R^{20}係獨立為H、CH_3、C_2H_5、n-C_3H_7、i-C_3H_7、i-C_4H_9、$CH(C_2H_5)_2$、CH_2-環丙基或環戊基；或R^{19}及R^{20}與其所附接之碳原子一起形成3-員碳環。

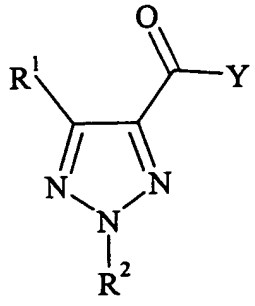
較佳之R^{21}為H或CH_3。

較佳之R^{22}為H或CH_3。

較佳之R^{23}為H或CH_3。

較佳之R^{24}為H或CH_3。

以下化合物(II)：



(II)

其中R^1及R^2定義如式(I)化合物之定義，且Y為鹵素、羥基或C_{1-5}烷氧基，係用作製備式(I)化合物之中間物。

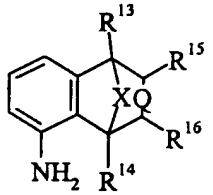
部分式(II)之化合物為文獻[B.Iddon等人, J. Chem. Soc. PerkinTrans. 1, 1341 (1996); M.Begtrup等人, Acta Chemica

Scand., 19, 2022 (1965); D. R. Buckle等人, J. Chem. Res, Syn. 10, 292 (1982);及A.Peratoner 等人, Sci. Fis. Mat. Nat. Rend 5, 16 (1907)]中已知，但其他為新穎化合物。

因此，本發明另一目的係提供一種式(II)化合物，其中R^1及R^2之定義均如式(I)化合物之定義，且Y為鹵素、羥基或C_{1-5}烷氧基；條件為當R^1為氯且R^2為4-CH_3O-C_6H_4-CH_2時，Y不為C_2H_5O；當R^1為CH_3O且R^2為CH_3，則Y不為C_2H_5O；當R^1為溴及R^2為CH_3OCH_2，則Y不為CH_3O；且當R^1為CH_3且R^2為C_2H_5時，Y不為OH。

較好Y為羥基、氯、氟或C_{1-3}烷氧基。

部分式(IIIa)化合物亦為新穎，但部分敘述於文獻中[例如見L. A Paquette等人, J. Amer. Chem Soc. 99, 3734 (1977); H. Plieninger等人, Chem. Ber. 109, 2121 (1976); Kasansski等人, Zh. Obshch. Khim. (1959), 29, 2588; 及A. J. Kirby等人, J. Chem. Soc., Pertain Trans. 2, 1997, 1081]。



(IIIa)

式(IIIa)之苯胺為新穎，其中R^{13}、R^{14}、R^{15}、R^{16}、Q及X之定義均如式(I)之化合物；其條件為當R^{13}、R^{14}、R^{15}及R^{16}各為H，則在Q為雙鍵時X不為CH_2，且Q為單鍵或雙鍵時，X不為CH_2CH_2；且當R^{13}為CH_3，R^{14}為OCH_3且R^{15}及R^{16}均為H，則當Q為單鍵時X不為CH_2CH_2。

因此，又一目的中，本發明提供式(IIIa)化合物，其中R^{13}

、R^{14}、R^{15}、R^{16}、Q及X如上述式(I)化合物之定義；但當R^{13}、R^{14}、R^{15}及R^{16}各為H，則X不為CH_2，當Q為雙鍵且X不為CH_2CH_2，當Q為單鍵或雙鍵；且當R^{13}為CH_3，則R^{14}為OCH_3且R^{15}及R^{16}均為H，當Q為單鍵，則X不為CH_2CH_2。

式(I)、(II)及(IIIa)之化合物可以各種幾何與光學異構物或以互變體型式存在。本發明之各式涵蓋所有該異構物及互變體及依所有比例之其混合物，以及各向同性形式如氘化化合物。

下表1至28中之化合物說明本發明之化合物。

表1提供59種式(II)之化合物，其中R^1、R^2及Y均如表1中之定義。

表1

Compound Number	R^1	R^2	Y
1.01	CHF_2	CH_3	OH
1.02	CHF_2	CH_3	Cl
1.03	CHF_2	CH_3	OCH_3
1.04	CHF_2	CH_3	OC_2H_5
1.05	CHF_2	CH_3	$OC_3H_7(n)$
1.06	CHF_2	CH_3	$OC_3H_7(i)$
1.07	CHF_2	C_2H_5	OH
1.08	CHF_2	C_2H_5	Cl
1.09	CHF_2	C_2H_5	OCH_3
1.10	CHF_2	C_2H_5	OC_2H_5
1.11	CHF_2	C_2H_5	$OC_3H_7(n)$

1.12	CHF_2	C_2H_5	$OC_3H_7(i)$
1.13	CF_3	CH_3	OH
1.14	CF_3	CH_3	Cl
1.15	CF_3	CH_3	OCH_3
1.16	CF_3	CH_3	OC_2H_5
1.17	CF_3	CH_3	$OC_3H_7(n)$
1.18	CF_3	CH_3	$OC_3H_7(i)$
1.19	CF_3	C_2H_5	OH
1.20	CF_3	C_2H_5	Cl
1.21	CF_3	C_2H_5	OCH_3
1.22	CF_3	C_2H_5	OC_2H_5
1.23	CF_3	C_2H_5	$OC_3H_7(n)$
1.24	CF_3	C_2H_5	$OC_3H_7(i)$
1.25	CF_3	CH_2OCH_3	OH
1.26	CF_3	CH_2OCH_3	Cl
1.27	CF_3	CH_2OCH_3	OCH_3
1.28	CF_3	CH_2OCH_3	OC_2H_5
1.29	CF_3	CH_2OCH_3	$OC_3H_7(n)$
1.30	CF_3	CH_2OCH_3	$OC_3H_7(i)$
1.31	CF_3	CH_3	F
1.32	CHF_2	CH_3	F
1.33	CHF_2	CH_2OCH_3	OH
1.34	CHF_2	CH_2OCH_3	OCH_3
1.35	CHF_2	CH_2OCH_3	OC_2H_5
1.36	CF_3	CH_2SCH_3	OH
1.37	CF_3	CH_2SCH_3	OCH_3
1.38	CN	CH_3	OCH_3
1.39	OCF_3	CH_3	OCH_3
1.40	NO_2	CH_3	OCH_3
1.41	CH_3	CH_3	OH
1.42	CH_3	CH_3	OCH_3
1.43	CH_3	CH_3	Cl
1.44	CH_3	C_2H_5	OH
1.45	C_2F_5	CH_3	OCH_3
1.46	CF_3	CF_3	OCH_3
1.47	CH_3	CF_3	OCH_3
1.48	CH_2F	CH_3	OH
1.49	CH_2F	CH_3	Cl
1.50	CH_2F	CH_3	OCH_3
1.51	CH_2F	CH_3	OC_2H_5
1.52	CH_2F	CH_3	$OC_3H_7(n)$
1.53	CH_2F	CH_3	$OC_3H_7(i)$
1.54	CH_2F	C_2H_5	OH
1.55	CH_2F	C_2H_5	Cl
1.56	CH_2F	C_2H_5	OCH_3
1.57	CH_2F	C_2H_5	OC_2H_5

1.58	CH_2F	C_2H_5	$OC_3H_7(n)$
1.59	CH_2F	C_2H_5	$OC_3H_7(i)$

表X代表表2[當X為2時]、表3[當X為3時]、表4[當X為4時]、表5[當X為5時]、表6[當X為6時]、及代表表7[當X為7時]。

表X

Cmpd. No.	R^2	R^3	R^6	R^7
X.001	CH_3	H	苯基	H
X.002	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	苯基	H
X.003	CH_3	H	2'-氟苯基	H
X.004	CH_3	H	3'-氟苯基	H
X.005	CH_3	H	4'-氟苯基	H
X.006	C_2H_5	H	4'-氟苯基	H
X.007	CH_2OCH_3	H	4'-氟苯基	H
X.008	CH_3	$COCH_3$	4'-氟苯基	H
X.009	CH_3	$COCH_2OCH_3$	4'-氟苯基	H
X.010	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	4'-氟苯基	H
X.011	CH_3	$CH=C=CH_2$	4'-氟苯基	H
X.012	CH_3	COO-*tert*-Bu	4'-氟苯基	H
X.013	CH_3	H	4'-氟苯基	F
X.014	CH_3	H	4'-氟苯基	CH_3
X.015	CH_3	H	2'-氯苯基	H
X.016	CH_3	H	3'-氯苯基	H
X.017	CH_3	H	4'-氯苯基	H
X.018	C_2H_5	H	4'-氯苯基	H
X.019	CH_2OCH_3	H	4'-氯苯基	H
X.020	CH_3	$COCH_3$	4'-氯苯基	H
X.021	CH_3	$COCH_2OCH_3$	4'-氯苯基	H
X.022	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	4'-氯苯基	H
X.023	CH_3	$CH=C=CH_2$	4'-氯苯基	H
X.024	CH_3	COO-*tert*-Bu	4'-氯苯基	H
X.025	CH_3	H	4'-氯苯基	F
X.026	CH_3	H	4'-氯苯基	CH_3
X.027	CH_3	H	2'-溴苯基	H
X.028	CH_3	H	3'-溴苯基	H
X.029	CH_3	H	4'-溴苯基	H
X.030	C_2H_5	H	4'-溴苯基	H
X.031	CH_2OCH_3	H	4'-溴苯基	H
X.032	CH_3	$COCH_3$	4'-溴苯基	H
X.033	CH_3	$COCH_2OCH_3$	4'-溴苯基	H
X.034	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	4'-溴苯基	H
X.035	CH_3	$CH=C=CH_2$	4'-溴苯基	H
X.036	CH_3	COO-*tert*-Bu	4'-溴苯基	H
X.037	CH_3	H	4'-溴苯基	F
X.038	CH_3	H	4'-溴苯基	CH_3
X.039	CH_3	H	2'-碘苯基	H
X.040	CH_3	H	3'-碘苯基	H
X.041	CH_3	H	4'-碘苯基	H
X.042	CH_3	H	2'-CF_3-苯基	H
X.043	CH_3	H	3'-CF_3-苯基	H

X.044	CH_3	H	4'-CF_3-苯基	H
X.045	C_2H_5	H	4'-CF_3-苯基	H
X.046	CH_2OCH_3	H	4'-CF_3-苯基	H
X.047	CH_3	$COCH_3$	4'-CF_3-苯基	H
X.048	CH_3	$COCH_2OCH_3$	4'-CF_3-苯基	H
X.049	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	4'-CF_3-苯基	H
X.050	CH_3	COO-*tert*-Bu	4'-CF_3-苯基	H
X.051	CH_3	H	2'-OCF_3-苯基	H
X.052	CH_3	H	3'-OCF_3-苯基	H
X.053	CH_3	H	4'-OCF_3-苯基	H
X.054	C_2H_5	H	4'-OCF_3-苯基	H
X.055	CH_2OCH_3	H	4'-OCF_3-苯基	H
X.056	CH_3	$COCH_3$	4'-OCF_3-苯基	H
X.057	CH_3	$COCH_2OCH_3$	4'-OCF_3-苯基	H
X.058	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	4'-OCF_3-苯基	H
X.059	CH_3	COO-*tert*-Bu	4'-OCF_3-苯基	H
X.060	CH_3	$CH=C=CH_2$	4'-OCF_3-苯基	H
X.061	CH_3	H	4'-SCF_3-苯基	H
X.062	CH_3	H	2'-CH=NOH-苯基	H
X.063	CH_3	H	3'-CH=NOH-苯基	H
X.064	CH_3	H	4'-CH=NOH-苯基	H
X.065	CH_3	H	2'-CH=$NOCH_3$-苯基	H
X.066	CH_3	H	3'-CH=$NOCH_3$-苯基	H
X.067	CH_3	H	4'-CH=$NOCH_3$-苯基	H
X.068	CH_3	H	2'-CH=NOC_2H_5-苯基	H
X.069	CH_3	H	3'-CH=NOC_2H_5-苯基	H
X.070	CH_3	H	4'-CH=NOC_2H_5-苯基	H
X.071	CH_3	H	2'-CN-苯基	H
X.072	CH_3	H	3'-CN-苯基	H
X.073	CH_3	H	4'-CN-苯基	H
X.074	CH_3	H	2'-NO_2-苯基	H
X.075	CH_3	H	3'-NO_2-苯基	H
X.076	CH_3	H	4'-NO_2-苯基	H
X.077	CH_3	H	3',4'-二氟苯基	H
X.078	C_2H_5	H	3',4'-二氟苯基	H
X.079	CH_2OCH_3	H	3',4'-二氟苯基	H
X.080	CH_3	$COCH_3$	3',4'-二氟苯基	H
X.081	CH_3	$COCH_2OCH_3$	3',4'-二氟苯基	H
X.082	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	3',4'-二氟苯基	H
X.083	CH_3	COO-*tert*-Bu	3',4'-二氟苯基	H
X.084	CH_3	$CH=C=CH_2$	3',4'-二氟苯基	H
X.085	CH_3	H	3',4'-二氟苯基	F
X.086	CH_3	H	3',4'-二氟苯基	CH_3
X.087	CH_3	H	3',4'-二氯苯基	H
X.088	C_2H_5	H	3',4'-二氯苯基	H
X.089	CH_2OCH_3	H	3',4'-二氯苯基	H
X.090	CH_3	$COCH_3$	3',4'-二氯苯基	H
X.091	CH_3	$COCH_2OCH_3$	3',4'-二氯苯基	H
X.092	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	3',4'-二氯苯基	H
X.093	CH_3	COO-*tert*-Bu	3',4'-二氯苯基	H
X.094	CH_3	$CH=C=CH_2$	3',4'-二氯苯基	H
X.095	CH_3	H	3',4'-二氯苯基	F
X.096	CH_3	H	3',4'-二氯苯基	CH_3
X.097	CH_3	H	4'-氟-3'-氟-苯基	H
X.098	C_2H_5	H	4'-氟-3'-氟-苯基	H

X.099	CH_2OCH_3	H	4'-氯-3'-氟-苯基	H
X.100	CH_3	$COCH_3$	4'-氯-3'-氟-苯基	H
X.101	CH_3	$COCH_2OCH_3$	4'-氯-3'-氟-苯基	H
X.102	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	4'-氯-3'-氟-苯基	H
X.103	CH_3	COO-*tert*-Bu	4'-氯-3'-氟-苯基	H
X.104	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	4'-氯-3'-氟-苯基	H
X.105	CH_3	H	4'-氯-3'-氟-苯基	F
X.106	CH_3	H	4'-氯-3'-氟-苯基	CH_3
X.107	CH_3	H	4'-氯-3'-氟-苯基	H
X.108	C_2H_5	H	4'-氯-3'-氟-苯基	H
X.109	CH_2OCH_3	H	4'-氯-3'-氟-苯基	H
X.110	CH_3	$COCH_3$	4'-氯-3'-氟-苯基	H
X.111	CH_3	$COCH_2OCH_3$	4'-氯-3'-氟-苯基	H
X.112	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	4'-氯-3'-氟-苯基	H
X.113	CH_3	COO-*tert*-Bu	4'-氯-3'-氟-苯基	H
X.114	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	4'-氯-3'-氟-苯基	H
X.115	CH_3	H	4'-氯-3'-氟-苯基	F
X.116	CH_3	H	4'-氯-3'-氟-苯基	CH_3
X.117	CH_3	H	2'-4'-二氯-苯基	H
X.118	CH_2OCH_3	H	2'-4'-二氯-苯基	H
X.119	CH_3	H	2'-4'-二氯-苯基	H
X.120	CH_2OCH_3	H	2'-4'-二氯-苯基	H
X.121	CH_3	H	$CH_2CH_2CH_3$	H
X.122	C_2H_5	H	$CH_2CH_2CH_3$	H
X.123	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2CH_3$	H
X.124	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2CH_3$	H
X.125	CH_3	H	$CH_2CH_2CH_2CH_3$	H
X.126	C_2H_5	H	$CH_2CH_2CH_2CH_3$	H
X.127	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2CH_2CH_3$	H
X.128	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2CH_2CH_3$	H
X.129	CH_3	H	$CH_2CH_2CH_2CH_3$	F
X.130	CH_3	H	$CH_2CH_2CH_2CH_3$	CH_3
X.131	CH_3	H	$CH_2CH_2CH_2(C_2H_5)$	H
X.132	C_2H_5	H	$CH_2CH_2CH_2(C_2H_5)$	H
X.133	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2CH_2(C_2H_5)$	H
X.134	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2CH_2(C_2H_5)$	H
X.135	CH_3	H	$CH_2CH_2CH_2(C_2H_5)$	F
X.136	CH_3	H	$CH_2CH_2CH_2(C_2H_5)$	CH_3
X.137	CH_3	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.138	C_2H_5	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.139	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.140	CH_3	$COCH_3$	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.141	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.142	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.143	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.144	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.145	CH_3	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$	F
X.146	CH_3	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$	CH_3
X.147	CH_3	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.148	C_2H_5	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.149	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.150	CH_3	$COCH_3$	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.151	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.152	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.153	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H

X.154	CH_3	$CH=C=CH_2$	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.155	CH_3	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	F
X.156	CH_3	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	CH_3
X.157	CH_3	H	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.158	C_2H_5	H	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.159	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.160	CH_3	$COCH_3$	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.161	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.162	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.163	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.164	CH_3	$CH=C=CH_2$	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.165	CH_3	H	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$	F
X.166	CH_3	H	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$	CH_3
X.167	CH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$	H
X.168	C_2H_5	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$	H
X.169	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$	H
X.170	CH_3	$COCH_3$	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$	H
X.171	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$	H
X.172	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$	H
X.173	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$	H
X.174	CH_3	$CH=C=CH_2$	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$	H
X.175	CH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$	F
X.176	CH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$	CH_3
X.177	CH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.178	C_2H_5	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.179	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.180	CH_3	$COCH_3$	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.181	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.182	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.183	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.184	CH_3	$CH=C=CH_2$	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.185	CH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	F
X.186	CH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	CH_3
X.187	CH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.188	C_2H_5	H	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.189	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.190	CH_3	$COCH_3$	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.191	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.192	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.193	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.194	CH_3	$CH=C=CH_2$	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.195	CH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	F
X.196	CH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	CH_3
X.197	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	H
X.198	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	H
X.199	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	H
X.200	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CH_3)CH_2CH_3$	H
X.201	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH_3$	H
X.202	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH_3$	H
X.203	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH_3$	H
X.204	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(C_2H_5)CH_2CH_3$	H
X.205	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2CH_3$	H
X.206	C_2H_5	H	$CH(CF_3)CH_2CH_3$	H
X.207	CH_2OCH_3	H	$CH(CF_3)CH_2CH_3$	H
X.208	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CF_3)CH_2CH_3$	H

X.209	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$	H
X.210	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$	H
X.211	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$	H
X.212	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$	H
X.213	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH_2CH_3$	H
X.214	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH_2CH_3$	H
X.215	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH_2CH_3$	H
X.216	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(C_2H_5)CH_2CH_2CH_3$	H
X.217	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2CH_2CH_3$	H
X.218	C_2H_5	H	$CH(CF_3)CH_2CH_2CH_3$	H
X.219	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.220	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.221	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.222	CH_3	$COCH_3$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.223	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.224	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.225	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.226	CH_3	$CH=C=CH_2$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.227	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$	F
X.228	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$	CH_3
X.229	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.230	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.231	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.232	CH_3	$COCH_3$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.233	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.234	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.235	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.236	CH_3	$CH=C=CH_2$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.237	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	F
X.238	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	CH_3
X.239	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.240	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.241	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.242	CH_3	$COCH_3$	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.243	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.244	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.245	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.246	CH_3	$CH=C=CH_2$	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.247	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$	F
X.248	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$	CH_3
X.249	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.250	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.251	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.252	CH_3	$COCH_3$	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.253	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.254	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.255	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.256	CH_3	$CH=C=CH_2$	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.257	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$	F
X.258	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$	CH_3
X.259	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.260	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.261	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.262	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.263	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(C_2H_5)_2$	H

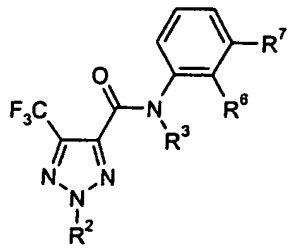
X.264	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.265	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.266	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(C_2H_5)CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.267	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.268	C_2H_5	H	$CH(CF_3)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.269	CH_2OCH_3	H	$CH(CF_3)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.270	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CF_3)CH_2CH(CH_3)_2$	H
X.271	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$	H
X.272	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$	H
X.273	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.274	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.275	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.276	CH_3	$COCH_3$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.277	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.278	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.279	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.280	CH_3	$CH=C=CH_2$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.281	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$	F
X.282	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$	CH_3
X.283	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.284	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.285	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.286	CH_3	$COCH_3$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.287	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.288	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.289	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.290	CH_3	$CH=C=CH_2$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.291	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	F
X.292	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	CH_3
X.293	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.294	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.295	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.296	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.297	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.298	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.299	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.300	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.301	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.302	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.303	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.304	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.305	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.306	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.307	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.308	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.309	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.310	C_2H_5	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.311	CH_2OCH_3	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.312	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_3$	H
X.313	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.314	C_2H_5	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.315	CH_2OCH_3	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.316	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$	H
X.317	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.318	C_2H_5	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H

X.319	CH_2OCH_3	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.320	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$	H
X.321	CH_3	H	2'-第三-丁基-環丙基	H
X.322	C_2H_5	H	2'-第三-丁基-環丙基	H
X.323	CH_2OCH_3	H	2'-第三-丁基-環丙基	H
X.324	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	2'-第三-丁基-環丙基	H
X.325	CH_3	H	2'-異丁基-環丙基	H
X.326	C_2H_5	H	2'-異丁基-環丙基	H
X.327	CH_2OCH_3	H	2'-異丁基-環丙基	H
X.328	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	2'-異丁基-環丙基	H
X.329	CH_3	H	4', 4'-二甲基-環丁基	H
X.330	C_2H_5	H	4', 4'-二甲基-環丁基	H
X.331	CH_2OCH_3	H	4', 4'-二甲基-環丁基	H
X.332	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	4', 4'-二甲基-環丁基	H
X.333	CH_3	H	環戊基	H
X.334	C_2H_5	H	環戊基	H
X.335	CH_2OCH_3	H	環戊基	H
X.336	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	環戊基	H
X.337	CH_3	H	3'-甲基-環戊基	H
X.338	C_2H_5	H	3'-甲基-環戊基	H
X.339	CH_2OCH_3	H	3'-甲基-環戊基	H
X.340	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	3'-甲基-環戊基	H
X.341	CH_3	H	環己基	H
X.342	C_2H_5	H	環己基	H
X.343	CH_2OCH_3	H	環己基	H
X.344	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	環己基	H
X.345	CH_3	H	3'-甲基-環己基	H
X.346	C_2H_5	H	3'-甲基-環己基	H
X.347	CH_2OCH_3	H	3'-甲基-環己基	H
X.348	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	3'-甲基-環己基	H
X.349	CH_3	H	4'-甲基-環己基	H
X.350	C_2H_5	H	4'-甲基-環己基	H
X.351	CH_2OCH_3	H	4'-甲基-環己基	H
X.352	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	4'-甲基-環己基	H
X.353	CH_3	H	環庚基	H
X.354	C_2H_5	H	環庚基	H
X.355	CH_2OCH_3	H	環庚基	H
X.356	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	環庚基	H
X.357	CH_3	H	2'-噻吩基	H
X.358	C_2H_5	H	2'-噻吩基	H
X.359	CH_2OCH_3	H	2'-噻吩基	H
X.360	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	2'-噻吩基	H
X.361	CH_3	H	3'-噻吩基	H
X.362	C_2H_5	H	3'-噻吩基	H
X.363	CH_2OCH_3	H	3'-噻吩基	H
X.364	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	3'-噻吩基	H
X.365	CH_3	H	5'-氯-2'-噻吩基	H
X.366	C_2H_5	H	5'-氯-2'-噻吩基	H
X.367	CH_2OCH_3	H	5'-氯-2'-噻吩基	H
X.368	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	5'-氯-2'-噻吩基	H
X.369	CH_3	H	2'-呋喃基	H
X.370	C_2H_5	H	2'-呋喃基	H
X.371	CH_2OCH_3	H	2'-呋喃基	H
X.372	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	2'-呋喃基	H
X.373	CH_3	H	5'-氯-2'-呋喃基	H

X.374	C_2H_5	H	5'-氯-2'-呋喃基	H
X.375	CH_2OCH_3	H	5'-氯-2'-呋喃基	H
X.376	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	5'-氯-2'-呋喃基	H
X.377	CH_3	H	2'-吡啶基	H
X.378	C_2H_5	H	2'-吡啶基	H
X.379	CH_2OCH_3	H	2'-吡啶基	H
X.380	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	2'-吡啶基	H
X.381	CH_3	H	3'-吡啶基	H
X.382	C_2H_5	H	3'-吡啶基	H
X.383	CH_2OCH_3	H	3'-吡啶基	H
X.384	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	3'-吡啶基	H
X.385	CH_3	H	4'-吡啶基	H
X.386	C_2H_5	H	4'-吡啶基	H
X.387	CH_2OCH_3	H	4'-吡啶基	H
X.388	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	4'-吡啶基	H
X.389	CH_3	H	6'-氯-3'-吡啶基	H
X.390	C_2H_5	H	6'-氯-3'-吡啶基	H
X.391	CH_2OCH_3	H	6'-氯-3'-吡啶基	H
X.392	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	6'-氯-3'-吡啶基	H
X.393	CH_3	H	6'-氟-3'-吡啶基	H
X.394	C_2H_5	H	6'-氟-3'-吡啶基	H
X.395	CH_2OCH_3	H	6'-氟-3'-吡啶基	H
X.396	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	6'-氟-3'-吡啶基	H
X.397	CH_3	H	6'-溴-3'-吡啶基	H
X.398	C_2H_5	H	6'-溴-3'-吡啶基	H
X.399	CH_2OCH_3	H	6'-溴-3'-吡啶基	H
X.400	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	6'-溴-3'-吡啶基	H
X.401	CH_3	H	2'-噁唑基	H
X.402	CH_3	H	3'-噁唑基	H
X.403	CH_3	H	$CH(CH_3)_2$	H
X.404	C_2H_5	H	$CH(CH_3)_2$	H
X.405	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)_2$	H
X.406	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(CH_3)_2$	H
X.407	CH_3	H	4'-CH=NO(*n*)-C_4H_9-苯基	H
X.408	CH_3	H	4'-CH=NO(*iso*)-C_4H_9-苯基	H
X.409	CH_3	H	4'-CH=NO(*iso*)-C_3H_7-苯基	H
X.410	CH_3	H	4'-CH=NO(*n*)-C_3H_7-苯基	H
X.411	CH_3	H	$Si(CH_3)_3$	H
X.412	C_2H_5	H	$Si(CH_3)_3$	H
X.413	CH_2OCH_3	H	$Si(CH_3)_3$	H
X.414	CH3	$CH_2C{\equiv}CH$	$Si(CH_3)_3$	H
X.415	CH_3	H	$CH_2Si(CH_3)_3$	H
X.416	C_2H_5	H	$CH_2Si(CH_3)_3$	H
X.416	CH_2OCH_3	H	$CH_2Si(CH_3)_3$	H
X.418	CH3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2Si(CH_3)_3$	H
X.419	CH_3	H	$CH(CH_3)Si(CH_3)_3$	H
X.420	C_2H_5	H	$CH(CH_3)Si(CH_3)_3$	H
X.421	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)Si(CH_3)_3$	H
X.422	CH3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(CH_3)Si(CH_3)_3$	H
X.423	CH_3	H	$CH_2CH_2Si(CH_3)_3$	H
X.424	C_2H_5	H	$CH_2CH_2Si(CH_3)_3$	H
X.425	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2Si(CH_3)_3$	H
X.426	CH3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2Si(CH_3)_3$	H
X.427	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2Si(CH_3)_3$	H
X.428	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2Si(CH_3)_3$	H

X.429	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2Si(CH_3)_3$	H
X.430	CH3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(CH_3)CH_2Si(CH_3)_3$	H
X.431	CH_3	H	$CH_2CH_2CH_2Si(CH_3)_3$	H
X.432	C_2H_5	H	$CH_2CH_2CH_2Si(CH_3)_3$	H
X.433	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2CH_2Si(CH_3)_3$	H
X.434	CH3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2CH_2Si(CH_3)_3$	H
X.435	CH_3	H	$CH_2Si(CH_3)_2C_2H_5$	H
X.436	CH_3	H	$CH_2Si(CH_3)_2CH(CH_3)_2$	H
X.437	CH_3	H	$CH_2Si(CH_3)_2OCH_3$	H
X.438	CH_3	H	$CH_2CH_2Si(CH_3)_2OCH_3$	H
X.439	CH_3	H	$CH(CH_3)Si(CH_3)_2OCH_3$	H
X.440	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2Si(CH_3)_2OCH_3$	H
X.441	CH_3	H	2'-環丙基-環丙基	H
X.442	C_2H_5	H	2'-環丙基-環丙基	H
X.443	CH_2OCH_3	H	2'-環丙基-環丙基	H
X.444	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	2'-環丙基-環丙基	H
X.445	CH_3	H	2'-(α-CH_3-環丙基)-環丙基	H
X.446	C_2H_5	H	2'-(α-CH_3-環丙基)-環丙基	H
X.447	CH_2OCH_3	H	2'-(α-CH_3-環丙基)-環丙基	H
X.448	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	2'-(α-CH_3-環丙基)-環丙基	H
X.449	CH_3	H	2'-環丁基-環丙基	H
X.450	CH_3	H	2'-環戊基-環丙基	H
X.451	CH_3	H	2'-環己基-環丙基	H
X.452	CH_3	H	4'-C≡CH-苯基	H
X.453	C_2H_5	H	4'-C≡CH-苯基	H
X.454	CH_3	H	4'-C≡C-$Si(CH_3)_3$-苯基	H
X.455	C_2H_5	H	4'-C≡C-$Si(CH_3)_3$-苯基	H
X.456	CH_3	H	4'-C(H)=CH_2-苯基	H
X.457	C_2H_5	H	4'-C(H)=CH_2-苯基	H

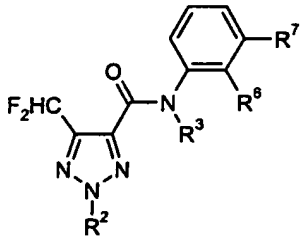
表2提供457種下式(I-2)之化合物：



(I-2)

其中R^2、R^3、R^6及R^7均如表2中之定義。

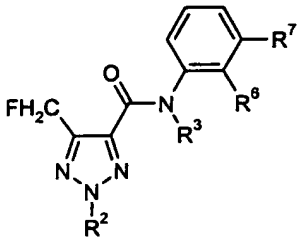
表3提供457種下式(I-3)之化合物：



(I-3)

其中R^2、R^3、R^6及R^7均如表3中之定義。

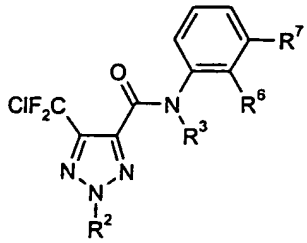
表4提供457種下式(I-4)之化合物：



(I-4)

其中R^2、R^3、R^6及R^7均如表4中之定義。

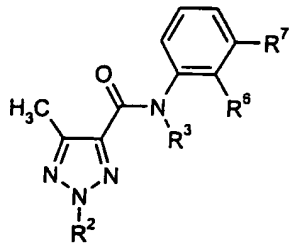
表5提供457種下式(I-5)之化合物：



(I-5)

其中R^2、R^3、R^6及R^7均如表5中之定義。

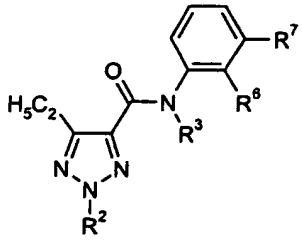
表6提供457種下式(I-6)之化合物：



(I-6)

其中R^2、R^3、R^6及R^7均如表6中之定義。

表7提供457種下式(I-7)之化合物：



(I-7)

其中R^2、R^3、R^6及R^7均如表7中之定義。

表Y代表表8[當Y為8時]、表9[當Y為9時]、表10[當Y為10時]、表11[當Y為11時]、表12[當Y為12時]、表13[當Y為13時]、表14[當Y為14時]、表15[當Y為15時]、表16[當Y為16時]、表17[當Y為17時]、表18[當Y為18時]，且代表表19[當Y為19時]。

表Y

Compound No.	R^2	R^3	R^6
Y.001	CH_3	H	苯基
Y.002	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	苯基
Y.003	CH_3	H	2'-氟苯基
Y.004	CH_3	H	3'-氟苯基
Y.005	CH_3	H	4'-氟苯基
Y.006	C_2H_5	H	4'-氟苯基
Y.007	CH_2OCH_3	H	4'-氟苯基
Y.008	CH_3	$COCH_3$	4'-氟苯基
Y.009	CH_3	$COCH_2OCH_3$	4'-氟苯基
Y.010	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	4'-氟苯基
Y.011	CH_3	$CH=C=CH_2$	4'-氟苯基
Y.012	CH_3	COO-*tert*-Bu	4'-氟苯基
Y.013	CH_3	H	2'-氯苯基
Y.014	CH_3	H	3'-氯苯基
Y.015	CH_3	H	4'-氯苯基
Y.016	C_2H_5	H	4'-氯苯基
Y.017	CH_2OCH_3	H	4'-氯苯基
Y.018	CH_3	$COCH_3$	4'-氯苯基
Y.019	CH_3	$COCH_2OCH_3$	4'-氯苯基
Y.020	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	4'-氯苯基

Y.021	CH_3	$CH=C=CH_2$	4'-氯苯基
Y.022	CH_3	COO-*tert*-Bu	4'-氯苯基
Y.023	CH_3	H	2'-溴苯基
Y.024	CH_3	H	3'-溴苯基
Y.025	CH_3	H	4'-溴苯基
Y.026	C_2H_5	H	4'-溴苯基
Y.027	CH_2OCH_3	H	4'-溴苯基
Y.028	CH_3	$COCH_3$	4'-溴苯基
Y.029	CH_3	$COCH_2OCH_3$	4'-溴苯基
Y.030	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	4'-溴苯基
Y.031	CH_3	$CH=C=CH_2$	4'-溴苯基
Y.032	CH_3	COO-*tert*-Bu	4'-溴苯基
Y.033	CH_3	H	2'-碘苯基
Y.034	CH_3	H	3'-碘苯基
Y.035	CH_3	H	4'-碘苯基
Y.036	CH_3	H	2'-CF_3-苯基
Y.037	CH_3	H	3'-CF_3-苯基
Y.038	CH_3	H	4'-CF_3-苯基
Y.039	C_2H_5	H	4'-CF_3-苯基
Y.040	CH_2OCH_3	H	4'-CF_3-苯基
Y.041	CH_3	$COCH_3$	4'-CF_3-苯基
Y.042	CH_3	$COCH_2OCH_3$	4'-CF_3-苯基
Y.043	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	4'-CF_3-苯基
Y.044	CH_3	COO-*tert*-Bu	4'-CF_3-苯基
Y.045	CH_3	H	2'-OCF_3-苯基
Y.046	CH_3	H	3'-OCF_3-苯基
Y.047	CH_3	H	4'-OCF_3-苯基
Y.048	C_2H_5	H	4'-OCF_3-苯基
Y.049	CH_2OCH_3	H	4'-OCF_3-苯基
Y.050	CH_3	$COCH_3$	4'-OCF_3-苯基
Y.051	CH_3	$COCH_2OCH_3$	4'-OCF_3-苯基
Y.052	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	4'-OCF_3-苯基
Y.053	CH_3	COO-*tert*-Bu	4'-OCF_3-苯基
Y.054	CH_3	$CH=C=CH_2$	4'-OCF_3-苯基
Y.055	CH_3	H	4'-SCF_3-苯基
Y.056	CH_3	H	2'-CH=NOH-苯基
Y.057	CH_3	H	3'-CH=NOH-苯基
Y.058	CH_3	H	4'-CH=NOH-苯基
Y.059	CH_3	H	2'-CH=$NOCH_3$-苯基
Y.060	CH_3	H	3'-CH=$NOCH_3$-苯基
Y.061	CH_3	H	4'-CH=$NOCH_3$-苯基
Y.062	CH_3	H	2'-CH=NOC_2H_5-苯基
Y.063	CH_3	H	3'-CH=NOC_2H_5-苯基
Y.064	CH_3	H	4'-CH=NOC_2H_5-苯基
Y.065	CH_3	H	2'-CN-苯基
Y.066	CH_3	H	3'-CN-苯基
Y.067	CH_3	H	4'-CN-苯基
Y.068	CH_3	H	2'-NO_2-苯基
Y.069	CH_3	H	3'-NO_2-苯基
Y.070	CH_3	H	4'-NO_2-苯基
Y.071	CH_3	H	3',4'-二氟苯基
Y.072	C_2H_5	H	3',4'-二氟苯基
Y.073	CH_2OCH_3	H	3',4'-二氟苯基
Y.074	CH_3	$COCH_3$	3',4'-二氟苯基
Y.075	CH_3	$COCH_2OCH_3$	3',4'-二氟苯基

Y.076	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	3',4'-二氯苯基
Y.077	CH_3	COO-*tert*-Bu	3',4'-二氯苯基
Y.078	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	3',4'-二氯苯基
Y.079	CH_3	H	3',4'-二氯苯基
Y.080	C_2H_5	H	3',4'-二氯苯基
Y.081	CH_2OCH_3	H	3',4'-二氯苯基
Y.082	CH_3	$COCH_3$	3',4'-二氯苯基
Y.083	CH_3	$COCH_2OCH_3$	3',4'-二氯苯基
Y.084	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	3',4'-二氯苯基
Y.085	CH_3	COO-*tert*-Bu	3',4'-二氯苯基
Y.086	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	3',4'-二氯苯基
Y.087	CH_3	H	4'-氯-3'-氟-苯基
Y.088	C_2H_5	H	4'-氯-3'-氟-苯基
Y.089	CH_2OCH_3	H	4'-氯-3'-氟-苯基
Y.090	CH_3	$COCH_3$	4'-氯-3'-氟-苯基
Y.091	CH_3	$COCH_2OCH_3$	4'-氯-3'-氟-苯基
Y.092	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	4'-氯-3'-氟-苯基
Y.093	CH_3	COO-*tert*-Bu	4'-氯-3'-氟-苯基
Y.094	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	4'-氯-3'-氟-苯基
Y.095	CH_3	H	3'-氯-4'-氟-苯基
Y.096	C_2H_5	H	3'-氯-4'-氟-苯基
Y.097	CH_2OCH_3	H	3'-氯-4'-氟-苯基
Y.098	CH_3	$COCH_3$	3'-氯-4'-氟-苯基
Y.099	CH_3	$COCH_2OCH_3$	3'-氯-4'-氟-苯基
Y.100	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	3'-氯-4'-氟-苯基
Y.101	CH_3	COO-*tert*-Bu	3'-氯-4'-氟-苯基
Y.102	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	3'-氯-4'-氟-苯基
Y.103	CH_3	H	2'-4'-二氯-苯基
Y.104	CH_2OCH_3	H	2'-4'-二氯-苯基
Y.105	CH_3	H	2'-4'-二氯-苯基
Y.106	CH_2OCH_3	H	2'-4'-二氯-苯基
Y.107	CH_3	H	$CH_2CH_2CH_3$
Y.108	C_2H_5	H	$CH_2CH_2CH_3$
Y.109	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2CH_3$
Y.110	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2CH_3$
Y.111	CH_3	H	$CH_2CH_2CH_2CH_3$
Y.112	C_2H_5	H	$CH_2CH_2CH_2CH_3$
Y.113	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2CH_2CH_3$
Y.114	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2CH_2CH_3$
Y.115	CH_3	H	$CH_2CH_2CH_2(C_2H_5)$
Y.116	C_2H_5	H	$CH_2CH_2CH_2(C_2H_5)$
Y.117	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2CH_2(C_2H_5)$
Y.118	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2CH_2(C_2H_5)$
Y.119	CH_3	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
Y.120	C_2H_5	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
Y.121	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
Y.122	CH_3	$COCH_3$	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
Y.123	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
Y.124	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
Y.125	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
Y.126	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	$CH_2CH_2CH(CH_3)_2$
Y.127	CH_3	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.128	C_2H_5	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.129	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.130	CH_3	$COCH_3$	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$

Y.131	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.132	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.133	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.134	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	$CH_2CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.135	CH_3	H	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.136	C_2H_5	H	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.137	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.138	CH_3	$COCH_3$	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.139	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.140	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.141	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.142	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	$CH_2CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.143	CH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$
Y.144	C_2H_5	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$
Y.145	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$
Y.146	CH_3	$COCH_3$	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$
Y.147	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$
Y.148	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$
Y.149	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$
Y.150	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	$CH_2CH_2C(CH_3)_3$
Y.151	CH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.152	C_2H_5	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.153	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.154	CH_3	$COCH_3$	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.155	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.156	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.157	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.158	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	$CH_2CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.159	CH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.160	C_2H_5	H	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.161	CH_2OCH_3	H	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.162	CH_3	$COCH_3$	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.163	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.164	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.165	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.166	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	$CH_2CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.167	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH_3$
Y.168	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2CH_3$
Y.169	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH_3$
Y.170	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(CH_3)CH_2CH_3$
Y.171	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH_3$
Y.172	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH_3$
Y.173	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH_3$
Y.174	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(C_2H_5)CH_2CH_3$
Y.175	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2CH_3$
Y.176	C_2H_5	H	$CH(CF_3)CH_2CH_3$
Y.177	CH_2OCH_3	H	$CH(CF_3)CH_2CH_3$
Y.178	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(CF_3)CH_2CH_3$
Y.179	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
Y.180	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
Y.181	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
Y.182	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$
Y.183	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH_2CH_3$
Y.184	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH_2CH_3$
Y.185	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH_2CH_3$

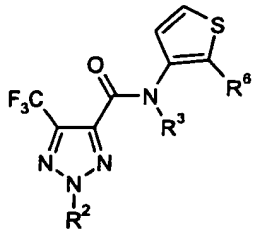
Y.186	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(C_2H_5)CH_2CH_2CH_3$
Y.187	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2CH_2CH_3$
Y.188	C_2H_5	H	$CH(CF_3)CH_2CH_2CH_3$
Y.189	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.190	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.191	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.192	CH_3	$COCH_3$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.193	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.194	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.195	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.196	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.197	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.198	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.199	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.200	CH_3	$COCH_3$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.201	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.202	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.203	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.204	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	$CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.205	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.206	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.207	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.208	CH_3	$COCH_3$	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.209	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.210	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.211	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.212	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	$CH(CH_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.213	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.214	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.215	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.216	CH_3	$COCH_3$	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.217	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.218	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.219	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.220	CH_3	$CH{=}C{=}CH_2$	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.221	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.222	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.223	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.224	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(C_2H_5)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.225	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.226	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.227	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.228	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(C_2H_5)CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.229	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.230	C_2H_5	H	$CH(CF_3)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.231	CH_2OCH_3	H	$CH(CF_3)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.232	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(CF_3)CH_2CH(CH_3)_2$
Y.233	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2CH(CH_3)(C_2H_5)$
Y.234	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2CH(C_2H_5)_2$
Y.235	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
Y.236	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
Y.237	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
Y.238	CH_3	$COCH_3$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
Y.239	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
Y.240	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$

Y.241	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
Y.242	CH_3	$CH=C=CH_2$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_3$
Y.243	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.244	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.245	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.246	CH_3	$COCH_3$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.247	CH_3	$COCH_2OCH_3$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.248	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.249	CH_3	COO-*tert*-Bu	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.250	CH_3	$CH=C=CH_2$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.251	CH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.252	C_2H_5	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.253	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.254	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CH_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.255	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_3$
Y.256	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_3$
Y.257	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_3$
Y.258	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_3$
Y.259	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.260	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.261	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.262	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.263	CH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.264	C_2H_5	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.265	CH_2OCH_3	H	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.266	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(C_2H_5)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.267	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_3$
Y.268	C_2H_5	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_3$
Y.269	CH_2OCH_3	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_3$
Y.270	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_3$
Y.271	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.272	C_2H_5	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.273	CH_2OCH_3	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.274	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)_2(C_2H_5)$
Y.275	CH_3	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.276	C_2H_5	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.277	CH_2OCH_3	H	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.278	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	$CH(CF_3)CH_2C(CH_3)(C_2H_5)_2$
Y.279	CH_3	H	2'-第三-丁基-環丙基
Y.280	C_2H_5	H	2'-第三-丁基-環丙基
Y.281	CH_2OCH_3	H	2'-第三-丁基-環丙基
Y.282	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	2'-第三-丁基-環丙基
Y.283	CH_3	H	2'-異丁基-環丙基
Y.284	C_2H_5	H	2'-異丁基-環丙基
Y.285	CH_2OCH_3	H	2'-異丁基-環丙基
Y.286	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	2'-異丁基-環丙基
Y.287	CH_3	H	4', 4'-二甲基-環丁基
Y.288	C_2H_5	H	4', 4'-二甲基-環丁基
Y.289	CH_2OCH_3	H	4', 4'-二甲基-環丁基
Y.290	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	4', 4'-二甲基-環丁基
Y.291	CH_3	H	環戊基
Y.292	C_2H_5	H	環戊基
Y.293	CH_2OCH_3	H	環戊基
Y.294	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	環戊基
Y.295	CH_3	H	3'-甲基-環戊基

Y.296	C_2H_5	H	3'-甲基-環戊基
Y.297	CH_2OCH_3	H	3'-甲基-環戊基
Y.298	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	3'-甲基-環戊基
Y.299	CH_3	H	環己基
Y.300	C_2H_5	H	環己基
Y.301	CH_2OCH_3	H	環己基
Y.302	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	環己基
Y.303	CH_3	H	3'-甲基-環己基
Y.304	C_2H_5	H	3'-甲基-環己基
Y.305	CH_2OCH_3	H	3'-甲基-環己基
Y.306	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	3'-甲基-環己基
Y.307	CH_3	H	4'-甲基-環己基
Y.308	C_2H_5	H	4'-甲基-環己基
Y.309	CH_2OCH_3	H	4'-甲基-環己基
Y.310	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	4'-甲基-環己基
Y.311	CH_3	H	環庚基
Y.312	C_2H_5	H	環庚基
Y.313	CH_2OCH_3	H	環庚基
Y.314	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	環庚基
Y.315	CH_3	H	2'-嘧吩基
Y.316	C_2H_5	H	2'-嘧吩基
Y.317	CH_2OCH_3	H	2'-嘧吩基
Y.318	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	2'-嘧吩基
Y.319	CH_3	H	3'-嘧吩基
Y.320	C_2H_5	H	3'-嘧吩基
Y.321	CH_2OCH_3	H	3'-嘧吩基
Y.322	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	3'-嘧吩基
Y.323	CH_3	H	5'-氯-2'-嘧吩基
Y.324	C_2H_5	H	5'-氯-2'-嘧吩基
Y.325	CH_2OCH_3	H	5'-氯-2'-嘧吩基
Y.326	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	5'-氯-2'-嘧吩基
Y.327	CH_3	H	2'-呋喃基
Y.328	C_2H_5	H	2'-呋喃基
Y.329	CH_2OCH_3	H	2'-呋喃基
Y.330	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	2'-呋喃基
Y.331	CH_3	H	5'-氯-2'-呋喃基
Y.332	C_2H_5	H	5'-氯-2'-呋喃基
Y.333	CH_2OCH_3	H	5'-氯-2'-呋喃基
Y.334	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	5'-氯-2'-呋喃基
Y.335	CH_3	H	2'-吡啶基
Y.336	C_2H_5	H	2'-吡啶基
Y.337	CH_2OCH_3	H	2'-吡啶基
Y.338	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	2'-吡啶基
Y.339	CH_3	H	3'-吡啶基
Y.340	C_2H_5	H	3'-吡啶基
Y.341	CH_2OCH_3	H	3'-吡啶基
Y.342	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	3'-吡啶基
Y.343	CH_3	H	4'-吡啶基
Y.344	C_2H_5	H	4'-吡啶基
Y.345	CH_2OCH_3	H	4'-吡啶基
Y.346	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	4'-吡啶基
Y.347	CH_3	H	6'-氯-3'-吡啶基
Y.348	C_2H_5	H	6'-氯-3'-吡啶基
Y.349	CH_2OCH_3	H	6'-氯-3'-吡啶基
Y.350	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	6'-氯-3'-吡啶基

Y.351	CH_3	H	6'-氟-3'-吡啶基
Y.352	C_2H_5	H	6'-氟-3'-吡啶基
Y.353	CH_2OCH_3	H	6'-氟-3'-吡啶基
Y.354	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	6'-氟-3'-吡啶基
Y.355	CH_3	H	6'-溴-3'-吡啶基
Y.356	C_2H_5	H	6'-溴-3'-吡啶基
Y.357	CH_2OCH_3	H	6'-溴-3'-吡啶基
Y.358	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	6'-溴-3'-吡啶基
Y.359	CH_3	H	2'-噁唑基
Y.360	CH_3	H	3'-異噁唑基
Y.361	CH_3	H	$CH(CH_3)_2$
Y.362	C_2H_5	H	$CH(CH_3)_2$
Y.363	CH_2OCH_3	H	$CH(CH_3)_2$
Y.364	CH_3	$CH_2C{\equiv}CH$	$CH(CH_3)_2$

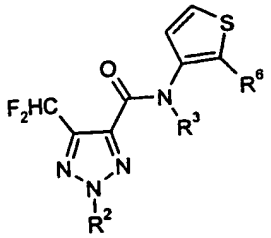
表8提供364種下式(I-8)之化合物：



(I-8)

其中R^2、R^3及R^6均如表8中之定義。

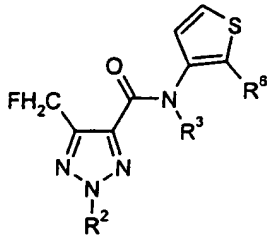
表9提供364種下式(I-9)之化合物：



(I-9)

其中R^2、R^3及R^6均如表9中之定義。

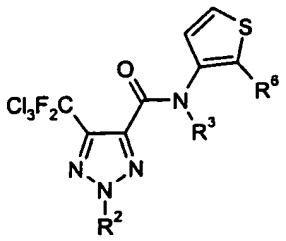
表10提供364種下式(I-10)之化合物：



(I-10)

其中R^2、R^3及R^6均如表10中之定義。

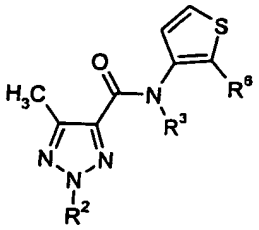
表11提供364種下式(I-11)之化合物：



(I-11)

其中R^2、R^3及R^6均如表11中之定義。

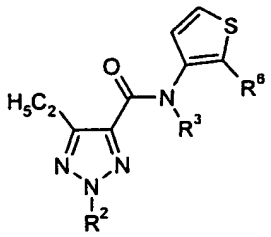
表12提供364種下式(I-12)之化合物：



(I-12)

其中R^2、R^3及R^6均如表12中之定義。

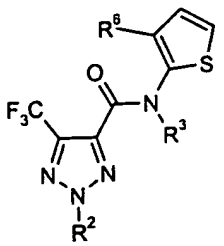
表13提供364種下式(I-13)之化合物：



(I-13)

其中R^2、R^3及R^6均如表13中之定義。

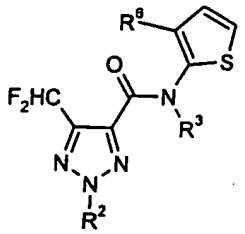
表14提供364種下式(I-14)之化合物：



(I-14)

其中R^2、R^3及R^6均如表14中之定義。

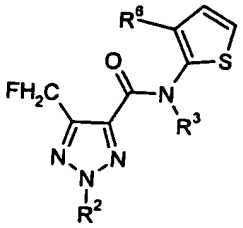
表15提供364種下式(I-15)之化合物：



(I-15)

其中R^2、R^3及R^6均如表15中之定義。

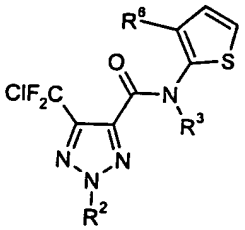
表16提供364種下式(I-16)之化合物：



(I-16)

其中R^2、R^3及R^6均如表16中之定義。

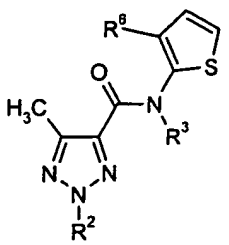
表17提供364種下式(I-17)之化合物：



(I-17)

其中R^2、R^3及R^6均如表17中之定義。

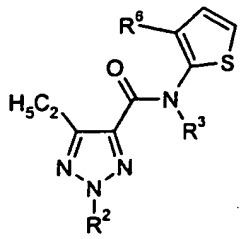
表18提供364種下式(I-18)之化合物：



(I-18)

其中R^2、R^3及R^6均如表18中之定義。

表19提供364種下式(I-19)之化合物：

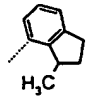
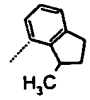
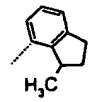


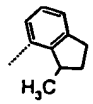
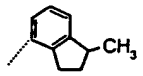
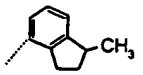
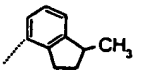
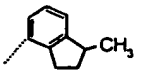
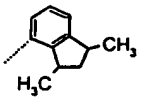
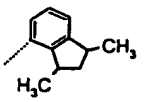
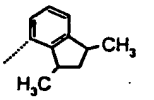
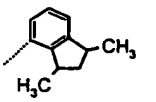
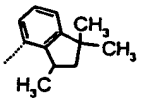
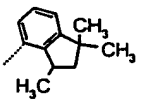
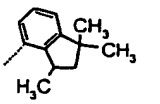
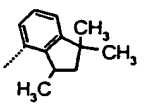
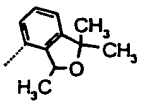
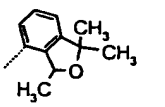
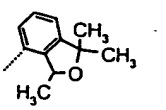
(I-19)

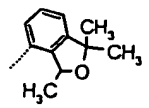
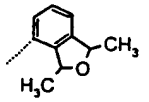
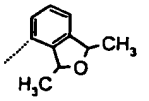
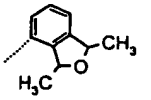
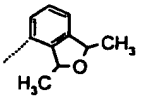
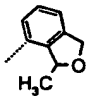
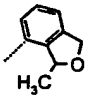
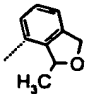
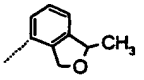
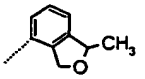
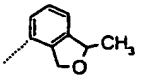
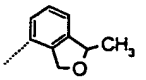
其中R^2、R^3及R^6均如表19中之定義。

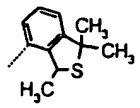
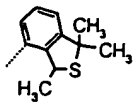
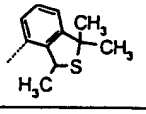
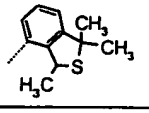
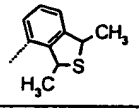
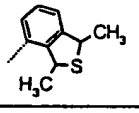
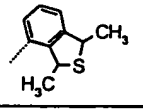
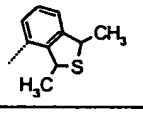
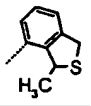
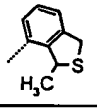
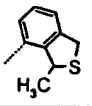
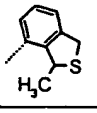
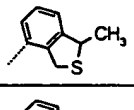
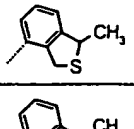
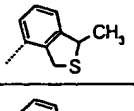
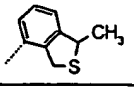
表Z代表表20[當Z為20時]、表21[當Z為21時]、表22[當Z為22時]、表23[當Z為23時]、表24[當Z為24時]且代表表25[當Z為25時]。

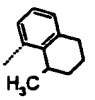
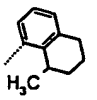
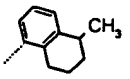
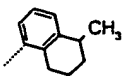
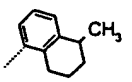
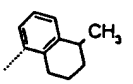
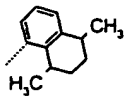
表Z

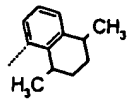
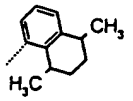
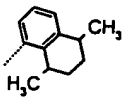
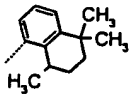
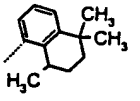
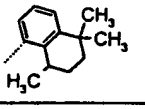
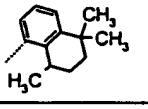
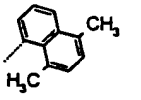
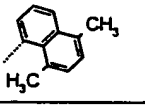
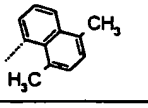
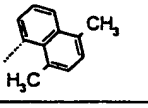
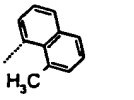
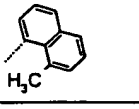
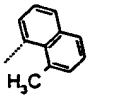
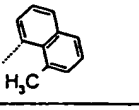
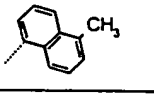
Compound No.	R^2	R^3	A
Z.001	CH_3	H	
Z.002	C_2H_5	H	
Z.003	CH_2OCH_3	H	
Z.004	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.005	CH_3	H	
Z.006	C_2H_5	H	
Z.007	CH_2OCH_3	H	

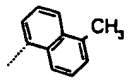
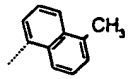
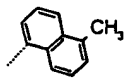
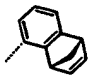
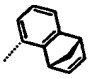
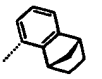
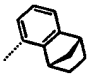
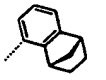
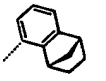
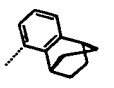
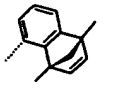
Z.008	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.009	CH_3	H	
Z.010	C_2H_5	H	
Z.011	CH_2OCH_3	H	
Z.012	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.013	CH_3	H	
Z.014	C_2H_5	H	
Z.015	CH_2OCH_3	H	
Z.016	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.017	CH_3	H	
Z.018	C_2H_5	H	
Z.019	CH_2OCH_3	H	
Z.020	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.021	CH_3	H	
Z.022	C_2H_5	H	
Z.023	CH_2OCH_3	H	

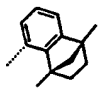
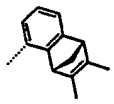
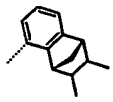
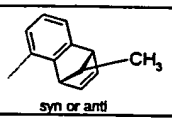
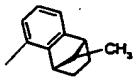
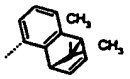
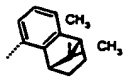
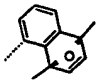
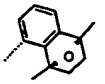
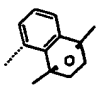
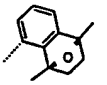
Z.024	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.025	CH_3	H	
Z.026	C_2H_5	H	
Z.027	CH_2OCH_3	H	
Z.028	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.029	CH_3	H	
Z.030	C_2H_5	H	
Z.031	CH_2OCH_3	H	
Z.032	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.033	CH_3	H	
Z.034	C_2H_5	H	
Z.035	CH_2OCH_3	H	
Z.036	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.037	CH_3	H	
Z.038	C_2H_5	H	
Z.039	CH_2OCH_3	H	
Z.040	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	

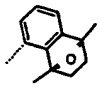
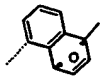
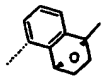
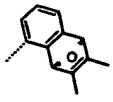
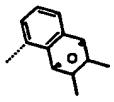
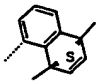
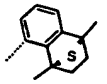
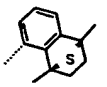
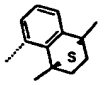
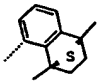
Z.041	CH_3	H	
Z.042	C_2H_5	H	
Z.043	CH_2OCH_3	H	
Z.044	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.045	CH_3	H	
Z.046	C_2H_5	H	
Z.047	CH_2OCH_3	H	
Z.048	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.049	CH_3	H	
Z.050	C_2H_5	H	
Z.051	CH_2OCH_3	H	
Z.052	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.053	CH_3	H	
Z.054	C_2H_5	H	
Z.055	CH_2OCH_3	H	
Z.056	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	

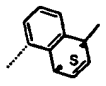
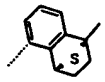
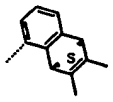
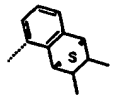
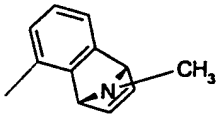
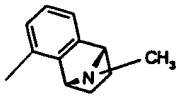
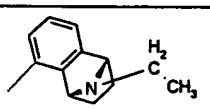
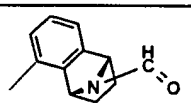
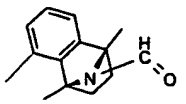
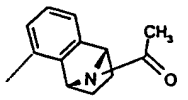
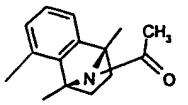
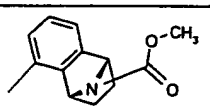
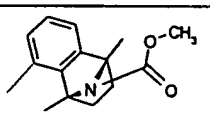
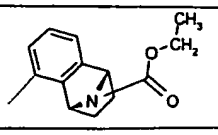
Z.057	CH_3	H	
Z.058	C_2H_5	H	
Z.059	CH_2OCH_3	H	
Z.060	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.061	CH_3	H	
Z.062	C_2H_5	H	
Z.063	CH_2OCH_3	H	
Z.064	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.065	CH_3	H	
Z.066	C_2H_5	H	
Z.067	CH_2OCH_3	H	
Z.068	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.069	CH_3	H	
Z.070	C_2H_5	H	
Z.071	CH_2OCH_3	H	
Z.072	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.073	CH_3	H	

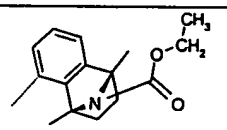
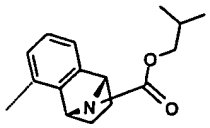
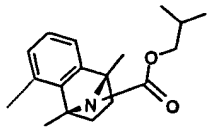
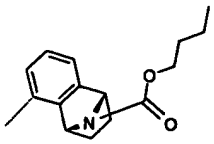
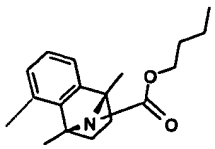
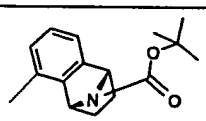
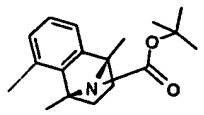
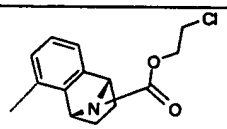
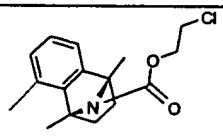
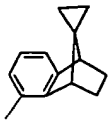
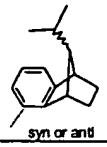
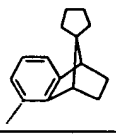
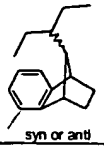
Z.074	C_2H_5	H	
Z.075	CH_2OCH_3	H	
Z.076	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.077	CH_3	H	
Z.078	C_2H_5	H	
Z.079	CH_2OCH_3	H	
Z.080	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.081	CH_3	H	
Z.082	C_2H_5	H	
Z.083	CH_2OCH_3	H	
Z.084	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.085	CH_3	H	
Z.086	C_2H_5	H	
Z.087	CH_2OCH_3	H	
Z.088	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.089	CH_3	H	

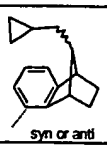
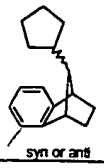
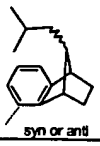
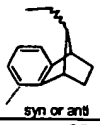
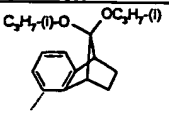
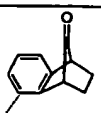
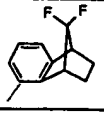
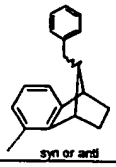
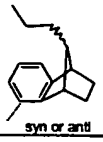
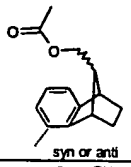
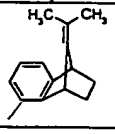
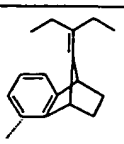
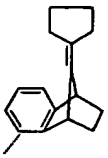
Z.090	C_2H_5	H	
Z.091	CH_2OCH_3	H	
Z.092	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.093	CH_3	H	
Z.094	C_2H_5	H	
Z.095	CH_2OCH_3	H	
Z.096	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.097	CH_3	H	
Z.098	C_2H_5	H	
Z.099	CH_2OCH_3	H	
Z.100	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.101	CH_3	H	
Z.102	C_2H_5	H	
Z.103	CH_2OCH_3	H	
Z.104	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.105	CH_3	H	
Z.106	CH_3	H	

Z.107	CH_3	H	
Z.108	CH_3	H	
Z.109	CH_3	H	
Z.110	CH_3	H	 syn or anti
Z.111	CH_3	H	 syn or anti
Z.112	CH_3	H	
Z.113	CH_3	H	
Z.114	CH_3	H	
Z.115	CH_3	H	
Z.116	C_2H_5	H	
Z.117	CH_2OCH_3	H	
Z.118	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.119	CH_3	H	
Z.120	CH_3	H	
Z.121	C_2H_5	H	
Z.122	CH_2OCH_3	H	

Z.123	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.124	CH_3	H	
Z.125	CH_3	H	
Z.126	CH_3	H	
Z.127	CH_3	H	
Z.128	CH_3	H	
Z.129	CH_3	H	
Z.130	CH_3	H	
Z.131	CH_3	H	
Z.132	C_2H_5	H	
Z.133	CH_2OCH_3	H	
Z.134	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	
Z.135	CH_3	H	
Z.136	CH_3	H	
Z.137	C_2H_5	H	
Z.138	CH_2OCH_3	H	
Z.139	CH_3	$CH_2C\equiv CH$	

Z.140	CH_3	H	
Z.141	CH_3	H	
Z.142	CH_3	H	
Z.143	CH_3	H	
Z.144	CH_3	H	
Z.145	CH_3	H	
Z.146	CH_3	H	
Z.147	CH_3	H	
Z.148	CH_3	H	
Z.149	CH_3	H	
Z.150	CH_3	H	
Z.151	CH_3	H	
Z.152	CH_3	H	
Z.153	CH_3	H	
Z.154	CH_3	H	
Z.155	CH_3	H	

Z.156	CH_3	H	
Z.157	CH_3	H	
Z.158	CH_3	H	
Z.159	CH_3	H	
Z.160	CH_3	H	
Z.161	CH_3	H	
Z.162	CH_3	H	
Z.163	CH_3	H	
Z.164	CH_3	H	
Z.165	CH_3	H	
Z.166	CH_3	H	 syn or anti
Z.167	CH_3	H	
Z.168	CH_3	H	 syn or anti

Z.169	CH_3	H	
Z.170	CH_3	H	
Z.171	CH_3	H	
Z.172	CH_3	H	
Z.173	CH_3	H	
Z.174	CH_3	H	
Z.175	CH_3	H	
Z.176	CH_3	H	
Z.177	CH_3	H	
Z.178	CH_3	H	
Z.179	CH_3	H	
Z.180	CH_3	H	
Z.181	CH_3	H	

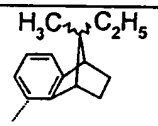
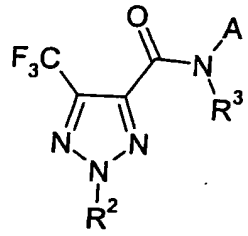
Z.182	CH_3	H	 In either configuration

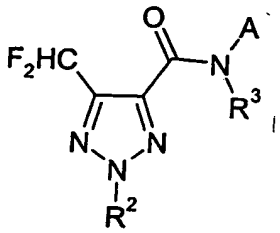
表20提供182種下式(I-20)之化合物：



(I-20)

其中R^2、R^3及A均如表20中之定義。

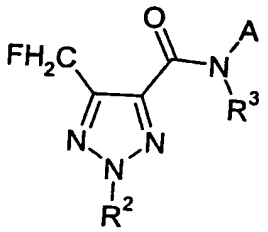
表21提供182種下式(I-21)之化合物：



(I-21)

其中R^2、R^3及A均如表21中之定義。

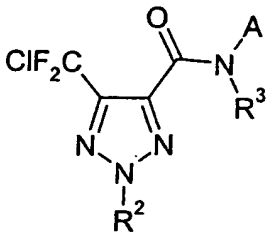
表22提供182種下式(I-22)之化合物：



(I-22)

其中R^2、R^3及A均如表22中之定義。

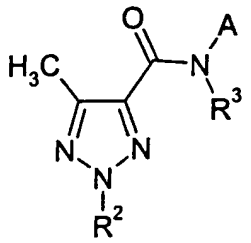
表23提供182種下式(I-23)之化合物：



(I-23)

其中R^2、R^3及A均如表23中之定義。

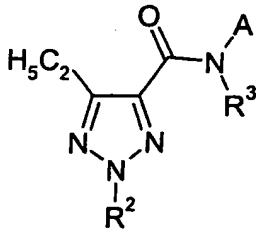
表24提供182種下式(I-24)之化合物：



(I-24)

其中R^2、R^3及A均如表24中之定義。

表25提供182種下式(I-25)之化合物：



(I-25)

其中R^2、R^3及A均如表25中之定義。

表26提供133種下式(IIIa)之化合物，其中R^{13}、R^{14}、R^{15}、R^{16}、Q及X均如表26中之定義。Q顯示為單鍵(-)或雙鍵(=)。

表26

Compound. No.	R^{13}	R^{14}	R^{15}	R^{16}	Q	X
26.001	CH_3	CH_3	H	H	=	O
26.002	CH_3	H	H	H	=	O
26.003	H	CH_3	H	H	=	O
26.004	CH_3	CH_3	$C(O)CH_3$	H	=	O
26.005	CH_3	CH_3	H	$C(O)CH_3$	=	O
26.006	CH_3	$C(O)CH_3$	H	H	=	O
26.007	H	H	H	H	=	O
26.008	CF_3	CF_3	H	H	=	O
26.009	OCH_3	OCH_3	H	H	=	O
26.010	H	H	CH_3	CH_3	=	O
26.011	C_2H_5	C_2H_5	H	H	=	O
26.012	CH_3	H	CH_3	H	=	O
26.013	H	CH_3	H	CH_3	=	O
26.014	CH_3	CH_3	H	H	–	O
26.015	CH_3	H	H	H	–	O
26.016	H	CH_3	H	H	–	O
26.017	CH_3	CH_3	$C(O)CH_3$	H	–	O
26.018	CH_3	CH_3	H	$C(O)CH_3$	–	O
26.019	CH_3	$C(O)CH_3$	H	H	–	O
26.020	H	H	H	H	–	O
26.021	CF_3	CF_3	H	H	–	O
26.022	OCH_3	OCH_3	H	H	–	O

26.023	H	H	CH_3	CH_3	–	O
26.024	C_2H_5	C_2H_5	H	H	–	O
26.025	CH_3	H	CH_3	H	–	O
26.026	H	H	H	H	–	CH_2
26.027	CH_3	H	CH_3	H	–	CH_2
26.028	CH_3	H	CH_3	H	=	CH_2
26.029	H	CH_3	H	CH_3	–	CH_2
26.030	H	CH_3	H	CH_3	=	CH_2
26.031	CH_3	CH_3	CH_3	CH_3	=	CH_2
26.032	CH_3	CH_3	CH_3	CH_3	–	CH_2
26.033	CH_3	CH_3	CH_3	CH_3	=	$CH(CH_3)$ syn or anti
26.034	CH_3	CH_3	CH_3	CH_3	–	$CH(CH_3)$ syn or anti
26.035	H	H	H	H	=	$CH(CH_3)$ syn or anti
26.036	H	H	H	H	–	$CH(CH_3)$ syn or anti
26.037	H	H	H	H	–	$CH(C_2H_5)$ syn or anti
26.038	H	H	H	H	–	CH_2CH_2
26.039	CH_3	CH_3	H	H	=	CH_2CH_2
26.040	CH_3	CH_3	H	H	–	CH_2CH_2
26.041	H	H	CH_3	CH_3	=	CH_2CH_2
26.042	H	H	CH_3	CH_3	–	CH_2CH_2
26.043	H	H	OCH_3	H	–	CH_2CH_2
26.044	H	H	H	OCH_3	–	CH_2CH_2
26.045	H	H	H	H	–	$CH_2CH_2CH_2$
26.046	H	H	H	H	=	$CH_2CH_2CH_2$
26.047	H	H	CH_3	CH_3	=	$C(CH_3)_2$
26.048	H	H	CH_3	CH_3	–	$C(CH_3)_2$
26.049	CH_3	CH_3	CH_3	CH_3	=	$C(CH_3)_2$
26.050	CH_3	CH_3	CH_3	CH_3	–	$C(CH_3)_2$
26.051	CH_3	H	CH_3	H	–	$C(CH_3)_2$
26.052	H	CH_3	H	CH_3	–	$C(CH_3)_2$
26.053	CH_3	H	CH_3	H	=	$C(CH_3)_2$
26.054	H	CH_3	H	CH_3	=	$C(CH_3)_2$
26.055	CH_3	CH_3	CH_3	CH_3	–	$C(CH_3)(C_2H_5)$
26.056	H	H	H	H	–	$C(CH_3)_2$
26.057	H	H	H	H	=	$C(CH_3)_2$
26.058	CH_3	CH_3	H	H	–	$C(CH_3)_2$
26.059	CH_3	CH_3	H	H	=	$C(CH_3)_2$
26.060	H	H	H	H	=	$C(OCH_3)_2$
26.061	H	H	H	H	–	$CH(OCH_3)$
26.062	H	H	H	H	=	S
26.063	H	H	H	H	–	S
26.064	CH_3	CH_3	H	H	=	S
26.065	CH_3	CH_3	H	H	–	S
26.066	H	H	CH_3	CH_3	=	S
26.067	H	H	CH_3	CH_3	–	S
26.068	OCH_3	OCH_3	H	H	=	S
26.069	OCH_3	OCH_3	H	H	–	S
26.070	H	CH_3	H	H	=	S
26.071	H	CH_3	H	H	–	S
26.072	CH_3	H	H	H	=	S

26.073	CH_3	H	H	H	–	S
26.074	CH_3	H	CH_3	H	=	S
26.075	CH_3	H	CH_3	H	–	S
26.076	H	CH_3	H	CH_3	=	S
26.077	H	CH_3	H	CH_3	–	S
26.078	H	OCH_3	H	H	=	S
26.079	H	OCH_3	H	H	–	S
26.080	OCH_3	H	H	H	=	S
26.081	OCH_3	H	H	H	–	S
26.082	CH_3	H	CH_3	CH_3	=	S
26.083	CH_3	H	CH_3	CH_3	–	S
26.084	H	CH_3	CH_3	CH_3	=	S
26.085	H	CH_3	CH_3	CH_3	–	S
26.086	H	H	CH_3	H	=	S
26.087	H	H	CH_3	H	–	S
26.088	H	H	H	CH_3	=	S
26.089	H	H	H	CH_3	–	S
26.090	H	H	OCH_3	H	=	S
26.091	H	H	OCH_3	H	–	S
26.092	H	H	H	OCH_3	=	S
26.093	H	H	H	OCH_3	–	S
26.094	H	H	H	H	=	$N(CH_3)$
26.095	H	H	H	H	–	$N(CH_3)$
26.096	CH_3	CH_3	H	H	=	$N(CH_3)$
26.097	CH_3	CH_3	H	H	–	$N(CH_3)$
26.098	H	H	H	H	=	$N(C_2H_5)$
26.099	H	H	H	H	–	$N(C_2H_5)$
26.100	H	H	H	H	–	NH
26.101	H	H	H	H	–	$NC(O)OC(CH_3)_3$
26.102	CH_3	CH_3	H	H	–	$NC(O)OC(CH_3)_3$
26.103	H	H	H	H	–	N(CHO)
26.104	H	H	H	H	–	$N(C(O)CH_3)$
26.105	CH_3	CH_3	H	H	–	$N(C(O)CH_3$
26.106	H	H	H	H	–	$N(C(O)OCH_3)$
26.107	CH_3	CH_3	H	H	–	$N(C(O)OCH_3)$
26.108	H	H	H	H	–	$N(C(O)OC_2H_5)$
26.109	CH_3	CH_3	H	H	–	$N(C(O)OC_2H_5)$
26.110	H	H	H	H	–	$N(C(O)OCH_2CH_2Cl)$
26.111	CH_3	CH_3	H	H	–	$N(C(O)OCH_2CH_2Cl)$
26.112	H	H	H	H	–	$N(C(O)OC_4H_9$-(*n*))
26.113	CH_3	CH_3	H	H	–	$N(C(O)OC_4H_9$-(*n*))
26.114	H	H	H	H	–	$N(C(O)OC_4H_9$-(*i*))
26.115	CH_3	CH_3	H	H	–	$N(C(O)OC_4H_9$-(*i*))
26.116	H	H	H	H	–	$CH(C_3H_7$-(*i*)) syn or anti
26.117	H	H	H	H	–	$CH(C_3H_7$-(*n*)) syn or anti
26.118	H	H	H	H	–	$CH(C_4H_9$-(*i*)) syn or anti
26.119	H	H	H	H	–	$C(C_2H_4$-(*c*))
26.120	H	H	H	H	–	$C(C_4H_8$-(*c*))
26.121	H	H	H	H	–	$CHCH(C_2H_5)_2$ syn or anti
26.122	H	H	H	H	–	$CHCH_2(C_3H_5$-(*c*)) syn or anti

26.123	H	H	H	H	–	CH(C_5H_9-(*c*)) syn or anti
26.124	H	H	H	H	–	$CHCH_2OC(=O)CH_3$ syn or anti
26.125	H	H	H	H	–	CH(CH=O) syn or anti
26.126	H	H	H	H	–	$CHCH_2OH$
26.127	H	H	H	H	–	$C(OC_3H_7\text{-}(n))_2$
26.128	H	H	H	H	–	C=O
26.129	H	H	H	H	–	$CHCH_2$-C_6H_5 syn or anti
26.130	H	H	H	H	–	$C=C(CH_3)_2$
26.131	H	H	H	H	–	$C=C(C_2H5)_2$
26.132	H	H	H	H	–	cyclopentylidene
26.133	H	H	H	H	–	$C(CH_3)(C_2H_5)$ In either configuration

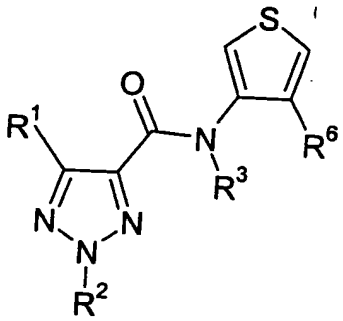
表ZZ代表表27(當ZZ為27時)及代表表28(當ZZ為28時)。

表ZZ

Compound No.	R^3	R^6	R^2	R^1
ZZ.1	H	$SiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.2	H	$SiMe_3$	Me	CF_2H
ZZ.3	H	CH_2SiMe_3	Me	CF_3
ZZ.4	H	CH_2SiMe_3	Me	CF_2H
ZZ.5	propargyl	CH_2SiMe_3	Me	CF_3
ZZ.6	H	$CHMeSiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.7	H	$CHMeSiMe_3$	Me	CF_2H
ZZ.8	propargyl	$CHMeSiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.9	allenyl	$CHMeSiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.10	COMe	$CHMeSiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.11	H	$CHMeSiMe_3$	Me	Me
ZZ.12	H	$(CH_2)_2SiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.13	H	$(CH_2)_2SiMe_3$	Me	CF_2H
ZZ.14	propargyl	$(CH_2)_2SiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.15	H	$(CH_2)_2SiMe_3$	Me	Me
ZZ.16	H	$(CH_2)_2SiMe_3$	CF_3	CF_3
ZZ.17	H	$CHMeCH_2SiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.18	H	$CHMeCH_2SiMe_3$	Me	CF_2H
ZZ.19	propargyl	$CHMeCH_2SiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.20	propargyl	$CHMeCH_2SiMe_3$	Me	CF_2H
ZZ.21	H	$CHMeCH_2SiMe_3$	Me	Me
ZZ.22	H	$CHMeCH_2SiMe_3$	CF_3	CF_3
ZZ.23	COMe	$CHMeCH_2SiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.24	H	$(CH_2)_3SiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.25	H	$(CH_2)_3SiMe_3$	Me	CF_2H
ZZ.26	H	$CH_2Si(Me_2)Et$	Me	CF_3

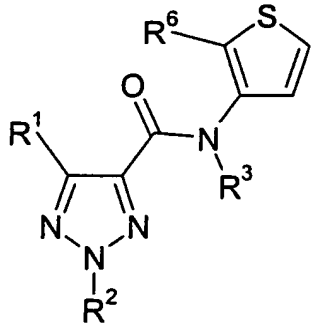
ZZ.27	H	$CH_2Si(Me_2)Et$	Me	CF_2H
ZZ.28	H	$CH_2Si(Me_2)CHMe_2$	Me	CF_3
ZZ.29	H	$CH_2Si(Me_2)CHMe_2$	Me	CF_2H
ZZ.30	H	$CH_2CHMeSiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.31	H	$CH_2CHMeSiMe_3$	Me	CF_2H
ZZ.32	H	$CMe_2CH_2SiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.33	H	$CMe_2CH_2SiMe_3$	Me	CF_2H
ZZ.34	H	$CHMeCHMeSiMe_3$	Me	CF_2H
ZZ.35	H	$CHMeCHMeSiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.36	H	$CH_2CMe_2SiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.37	H	$CH_2CMe_2SiMe_3$	Me	CF_2H
ZZ.38	H	$CHMe(CH_2)_2SiMe_3$	Me	CF_2H
ZZ.39	H	$CHMe(CH_2)_2SiMe_3$	Me	CF_3
ZZ.40	H	$(CH_2)_2SiMe_3$	CH_2OMe	CH_2Me
ZZ.41	H	$(CH_2)_2SiMe_3$	CH_2OCH_2Me	CH_2Me
ZZ.42	H	$SiMe_2CH_2CHMe_2$	Me	CF_3

表27提供42種式(I-27)之化合物，其中R^1、R^2、R^3及R^6均如表9中之定義。



(I-27)

表28提供42種式(I-28)之化合物，其中R^1、R^2、R^3及R^6均如表10中之定義。



(I-28)

全文中溫度為攝氏溫度，"NMR"意指核磁共振光譜，MS代表質譜；"%"為重量百分比，除非相對應之濃度以其他單位顯示，“syn”係指與環狀苯環有關之相關取代基之syn，且

"anti"係指與環狀苯環有關之相關取代基之反式結構。

以下簡寫用於全文中：

m.p.=溶點	b.p.=沸點
s=單峰	br=寬峰
d=雙峰	dd=雙峰之雙峰
t=三峰	q=四峰
m=多峰	ppm=百萬份

表29顯示表1至28之化合物之選擇溶點。

表29

Compound No.	m.p. / (°C)
1.03	56-57
1.13	176-177
1.15	liquid
1.50	64-66
2.005	146-147
2.017	148
2.029	148-149
2.067	165-166
2.070	139-142
2.219	94.6-95.4
2.273	125-126
2.321	124-125
2.411	117-118
2.427	103-105
2.423	105
2.445 (trans)	98-99
2.452	123-125
2.454	161-163
2.456	122-123
3.005	143-145
3.017	155-156
3.029	154-155
3.067	144-145
3.070	136-137
3.219	71-73
3.273	87-88
3.321	121-122
3.407	83-85
3.411	91-93
3.427	75-76

3.423	121-122
3.445	94-95
3.452	161-162
3.454	144-145
3.456	133-135
4.017	158-159
4.273	89-91
4.411	84-86
4.445	84-85
4.452	143-144
4.456	122-124
8.189	104-106
9.189	82-83
20.017	167-169
20.021	121-122
20.065	144-145
20.073	157-158
20.097	108-109
20.101	155-157
20.115	137-139
20.120	160-161
20.147	159-162 (分解)
20.148	133-139
20.149	無定型
20.161	無定型
20.166 (syn:anti 90:10)	150-153
20.166 (syn:anti 34:66)	111-116
20.168 (syn:anti 40:60)	102-120
20.169 (syn:anti 86:14)	105-109
20.170 (syn:anti 74:26)	無定型
20.171 (syn:anti 16: 84)	106-107
20.171 (syn:anti 81:19)	無定型
20.176 (syn:anti 80:20)	126-129
20.179	187-189
20.180	109-110
21.097	107-109
21.101	120-122
21.017	175-177
21.021	125-126
21.065	114-116
21.073	135-137
21.105	140-143
21.114	189-191
21.115	164-166
21.120	172-175
21.148	134-136

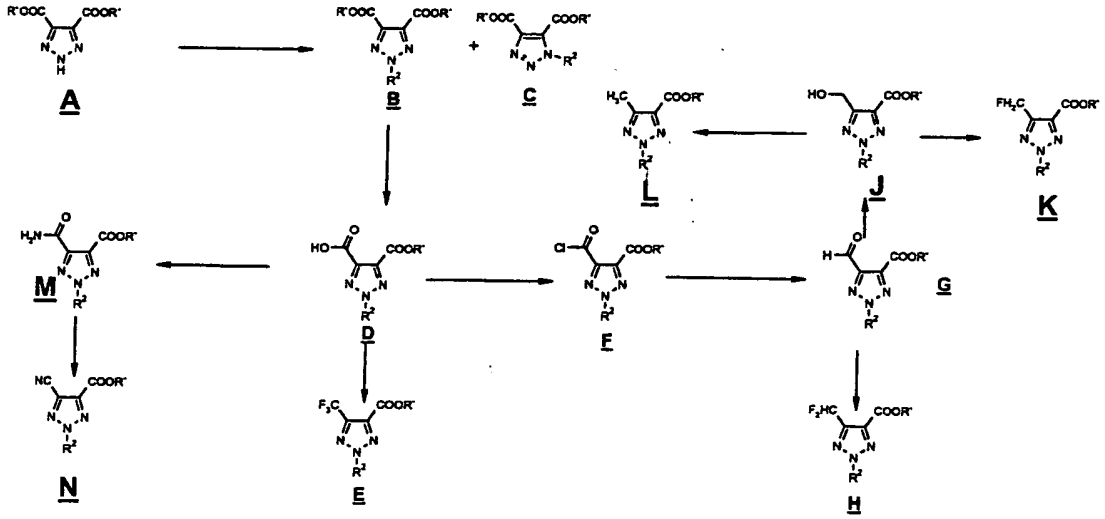
21.152	170-172
21.153	無定型
21.154	120-122
21.155	無定型
21.161	無定型
21.165(syn)	106-108
21.166 (syn:anti 90:10)	148-149
22.101	97-98
22.115	135-138
22.147	黏稠
22.148	130-132
22.149	無定型
22.161	無定型
26.001	92-96
26.007	121-124
26.014	92-93
26.015	115-116
26.016	92-93
26.020	75-76
26.026	63-64
26.038	74-75
26.095	139-140
26.099	黏稠
26.100	黏稠
26.101	89-90
26.102	94-95
26.103	176-177
26.105	110-111
26.106	104-105
26.107	114-115
26.108	黏稠
26.110	黏稠
26.112	黏稠
26.114	黏稠
26.116 (syn:anti 86:14)	蠟狀固狀
26.116 (syn:anti 35:65)	油狀
26.118 (syn:anti 10:90)	黏稠
26.118 (syn:anti 82:18)	黏稠
26.119	油狀
26.121 (syn:anti 50:50)	油狀
26.122 (syn:anti 84:14)	油狀
26.123 (syn:anti 75:25)	73-78
26.128 (syn:anti 74:26)	油狀
26.129	81-82
26.130	oil

式(I)化合物可以以下反應圖製備。

(a) 式(II)化合物之製備

反應1、2及3證明式E、H、K、L、N、O、P、R、S、T、U、V、W、Y或Z[其中R^1及R^2均如式(II)之定義；且R'為C_{1-5}烷基]{其各個均為如上述定義之式(II)化合物}均可以以式A之1,2,3-三唑-4,5-二羧酸二酯[Y. Tanaka等人, Tetrahedron, 29, 3271 (1973)][其中各R'獨立為C_{1-5}烷基](較好為二甲酯)起始之反應順序製備。

反應圖1



在周圍至高溫下，於適當溶劑[如乙腈、DMF或二甲基乙醯胺]中，在鹼[如K_2CO_3、Na_2CO_3或NEt_3]存在下，以烷化劑[如R^2-鹵基(其中R^2之定義如上述式(II)；且鹵基較好為碘)或適當硫酸酯、磺酸酯或碳酸酯]處理A可獲得式B及C之立體異構物混合物，其可以一般方法分離。使式B之化合物在質子溶劑[如甲醇]中，且較好在回流條件下，以至多一當量之鹼[如KOH、NaOH或LiOH]皂化，獲得式D之單酯類。接

著在氫氟酸存在下，使式D化合物與氟化劑[如DAST (三氟二乙基胺基硫)或較好為SF_4]反應，獲得式E之5-CF_3-1,2,3-三唑-4-羧酸酯。

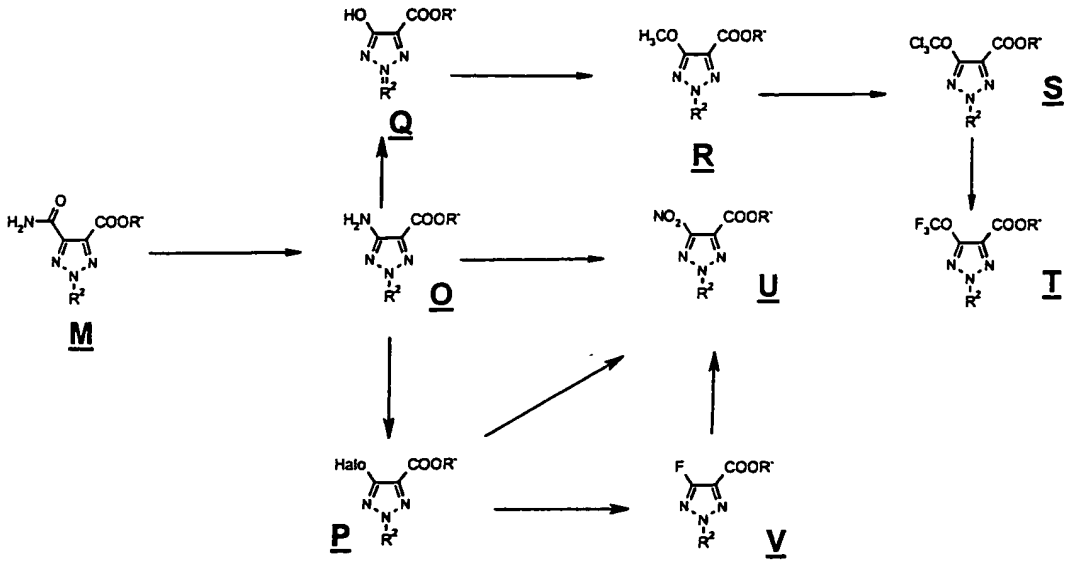
或者，在標準條件下以氯化劑[如硫醯氯或碳醯氯]處理式D之化合物，獲得式F之酸性氯化物，其可在惰性溶劑[例如乙酸以酯或THF]中，於鹼[例如Hunig鹼]存在下催化性還原，獲得式G之醛-酯(改善之Rosenmund條件)。式G之化合物藉由DAST、二甲氧基-DAST或SF_4，在氫氟酸存在下(式情況含溶劑)，且較好在高溫下氟化，形成式H之5-二氟甲基-1,2,3-三唑-4-羧酸酯。

在甲醇中使式G之化合物金屬氫化物還原[例如以$NaBH_4$或$LiBH_4$]，獲得式J之5-羥基甲基-1,2,3-三唑，藉由在適度條件下，且較好在低溫(0至-78℃)下於惰性溶劑[如二氯甲烷]中以DAST氟化，可自其獲得式K之5-氟甲基衍生物。

或者，藉由慣用之方法[例如經由其甲磺醯化或甲苯磺醯化或碘化物]使式J之化合物雜還原，獲得式L之-甲基-1,2,3-三唑。

式D化合物經氯化[例如以硫醯氯]，接著以胺水處理(劑好在質子溶劑[如水、甲醇或以醇]中)，獲得式M之醯胺，藉由脫水劑[如磷醯氯]可由其獲得式N之5-氰基-1,2,3-三唑。

反應圖2



進一步轉換以製備式(II)之化合物[其中R^1及R^2之定義均如式(I)；Y為OR'且R'為C_{1-5}烷基]包含在NaOH存在下，以NaOBr使式M之醯胺經Hofmann重排，獲得式O之5-醯胺-1,2,3-三唑。

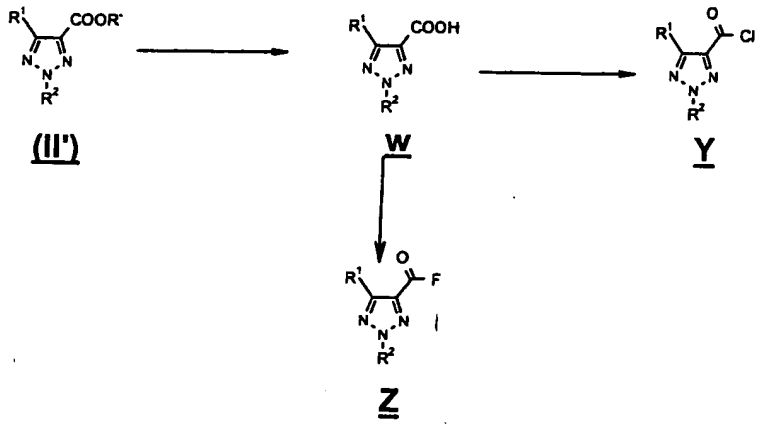
在酸水溶液條件下[例如硫酸]以硝酸鈉，或在鹵化物[如CuCl或CuBr]存在下，於有機溶劑[例如丙酮、二氯甲烷或THF]中以硝酸酯[例如硝酸(i)-戊酯]使式O化合物重氮化，獲得式P之5-鹵基-1,2,3-三唑[其中之鹵基為Cl或Br]，其以氟化劑[如KF或CsF]處理(較好在高溫下，於DMF或N-甲基比咯啉酮中)處理，獲得式V之5-氟-1,2,3-三唑。

在加熱下，藉由使式O之化合物重氮化接著以酸性水溶液水解，可獲得式Q之5-羥基-1,2,3-三唑。式Q之化合物在極性溶劑[例如DMF、DMSO或CH_3CN]中，以烷化劑[如甲基碘、硫酸二甲酯或碳酸二甲酯]及鹼[例如NaH、K_2CO_3或Na_2CO_3]處理，獲得式R之5-甲氧基-1,2,3-三唑，其可在高溫

下及偶氮異丁腈(AIBN)或超紫外線照射下，以氯化劑[如氯]轉化成式S之三氯甲氧基衍生物。藉由以氟化劑[例如KF或SbF_3]處理式S之化合物，可製備式T之5-三氟甲基-1,2,3-三唑。

式O之化合物以例如過硼酸鈉氧化或依據A. Sudalai等人[Angew. Chem. Int. Ed. 40, 405 (2001)]處理，獲得式U之5-硝基衍生物。或者，式U之化合物亦可藉由在極性溶劑[如DMF、環丁碸、或N-甲基比咯啉酮]中，於高溫下以$NaNO_2$處理式P或V之化合物製備。

反應圖3



式(II')化合物[其中R^1及R^2均如式(I)中之定義；Y為OR'且R'為C_{1-5}烷基]轉化獲得式(II)之化合物[其中R^1及R^2均如式(I)之定義，且Y為鹵基或羥基]包含在極性溶劑[如甲醇、乙醇或水]中，於周圍溫度或高溫下以鹼[如KOH或NaOH]皂化，獲得式W之1,2,3-三唑-4-羧酸。式W之化合物在標準條件[例如以硫醯氯、碳醯氯或草醯氯]氯化，獲得式Y之酸性氯化物。

式W之化合物在溫和條件[低至周圍溫度]下，且較好在惰性溶劑[如二氯甲烷]中以DAST或SF_4氟化，獲得式Z之酸性

氟化物。

(b) 式(III)化合物之製備

式(III)之化合物

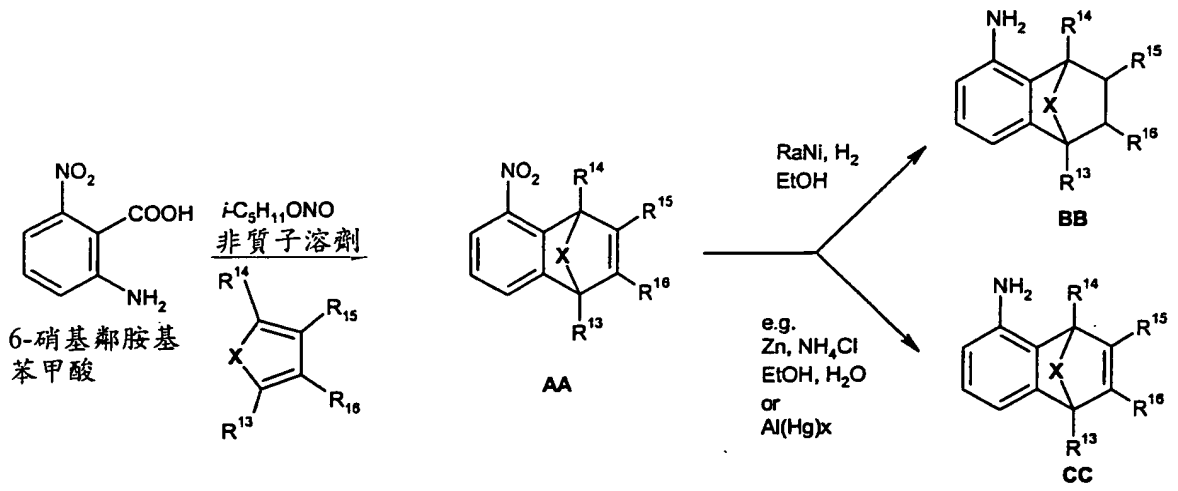
$$H_2N\text{-}A \qquad (III)$$

其中A係如式(I)之定義，係用作製備式(I)化合物之中間物。

大部分式(III)之鄰-取代胺基-芳基及胺基-雜芳基均為文獻中已知，但部分為新穎。

式(IIIa)之化合物可依據反應圖4製備：

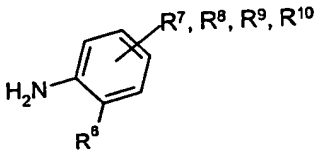
反應圖4



式AA鄰-取代硝基原冰片二烯(其中R^{13}、R^{14}、R^{15}及X均如上述式(I)之化合物)[經由就地產生之苯炔經Diels-Alder加成，例如由如L. Paquette等人,J. Amer. Chem. Soc. 99, 3734 (1977)所述之6-硝基鄰胺基苯甲酸起始，或由其他適用之苯炔前驅物(見H. Pellissier等人, Tetrahedron, 59, 701 (2003)起始，依據或與L. Paquette等人, J. Amer. Chem. Soc. 99, 3734 (1977), D. Gravel等人, Can. J. Chem. 69, 1193 (1991), J. R. Malpass等人, Tetrahedron, 48, 861 (1992), D. E. Lewis等人,

Synthetic Communications, 23, 993 (1993), R. N. Warrener等人, Molecules, 6, 353 (2001), R. N. Warrener等人, Molecules, 6, 194 (2001)或I. Fleming等人, J. Chem. Soc., Perkin Trans. 1, 2645 (1998))類似，以5-7員環狀1,4-二烯起始製備]，在氯化銨或鋁汞齊存在下，在質子溶劑[如乙醇或水]中，以Zn處理，獲得式CC之苯胺，同時在溶劑[例如THF、乙酸乙酯、甲醇或乙醇]存在下，以例如RaNi、Pd/C或Rh/C催化性氫化式AA之化合物，獲得式BB之苯胺。

式(IIIb)之化合物



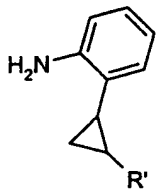
(IIIb)

其中R^6為脂系或脂環系，飽和或不飽和基[其中之基含三至十三個碳原子，及至少依矽原子，且視情況含一至三個各個均獨立選自氧、氮或硫之雜原子，且該基視情況以至多四個獨立選自鹵素原子之基取代]，且R^{7-10}均如式(I)中之定義，可以與文獻之實例類似般製備。參考文獻包含例如E. A. Chernyshew等人, Bull. Acad. Sci. USSR, 1960, 1323; K. T. Kang等人, Tetrahedron Letters, 32, 4341 (1991), Synthetic Comm., 24, 1507 (1994); M. Murata等人, Tetrahedron Letters 40, 9255 (1999); A.Falcou等人, Tetrahedron 56, 225 (2000); A. Arcadi等人, Tetrahedron Letters 27, 6397 (1986); 10 K. C. Nicolaou et al., Chem. Eur. J. 1, 318 (1995); N.Chatani et al., J.Org. Chem. 60, 834 (1995); T. Stuedemann et al., Tetrahedron

54, 1299 (1998); P. F. Hurdlik等人, J. Org.Chem. 54, 5613 (1989); K. Karabelas等人, J. Org. Chem. 51, 5286 (1986); T. Jeffery, Tetrahedron Letters 40, 1673 (1999) 及Tetrahedron Letters 41, 8445 (2000); K.Olofson等人, J. Org. Chem. 63, 5076 (1998); H.Uirata等人, Bull. Chem. Soc. Jap. 57, 607 (1984); 及G. Maas等人, Tetrahedron 49, 881 (1983)；且提出供參考。

針對將含Si官能度導入苯基衍生物中之最近回顧可見於"有機矽化合物之化學"第1-3冊，S. Patai, Z. Rappaport及Z. Rappaport, Y. Apeloid eds., Wiley 1989, 1998, 2001及"Houben-Weyl科學及合成", Organometallics Vol. 4, I. Fleming ed., G. Thieme 2002中。

苯胺之另一群組包含式(IIIc)之化合物

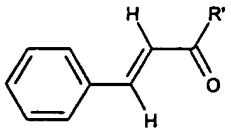


(IIIc)

其中R'代表C_{2-4}烷基、C_{2-4}鹵烷基或C_{3-6}環烷基(本身視情況以至多3個獨立選自鹵基、C_{1-3}烷基、C_{1-3}鹵烷基及C_{1-4}鹵烷氧基之取代基取代)。

式(IIIc)之化合物可藉由以交聯之丁間醛醇起始，使苯醛與式$CH_3C(O)R'$ [其中R'如式(IIIc)化合物之定義]之酮在溶劑(如水或乙醇)中，且通常在回流條件下，於NaOH或KOH存在下縮合，或者藉由使苯醛與Witting試劑在標準條件下反應之反應順序製備。所得之式(IV)之α,β-不飽和酮[其中

R'如上述化合物(IIIc)之定義]：



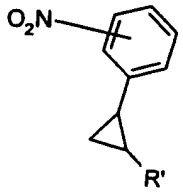
(IV)

可再轉化成式(V')之化合物[其中R'如上述化合物(IIIc)之定義]：



(V')

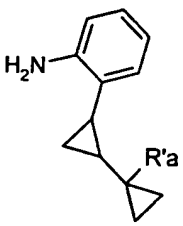
該轉化係藉由在乙醇中及回流條件下先與聯胺水合物反應，接著在KOH(蒸餾掉溶劑)存在下加熱(150至250℃)。在冷卻槽(-30℃至0℃之中)中以HNO_3-H_2O或HNO_3-乙酸酐氮化後，所得式(VI)之硝基苯之o/p-混合物[其中R'如上述化合物(IIIc)之定義]：



(VI)

可經分離且在溶劑(如甲醇、乙醇或THF)中，於周圍溫度下催化性還原(Pt/C/H_2或Ra-Ni/H_2)，獲得式(IIIc)之化合物。

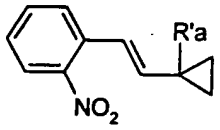
或者式(IIId)化合物之合成[其中R'^{a}為氫或甲基]



(IIId)

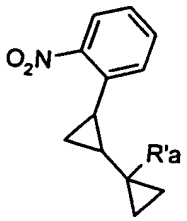
可在強鹼[如NaH]存在下，於溶劑[如DMSO]中，0-85℃下藉

由使鄰-硝基苯醛與炔化物(由環丙基甲基三苯基鏻溴製備)之Witting反應起始之反應順序達成。所得下式(VII)化合物之E/Z混合物



(VII)

可轉化成下式(VIII)之化合物

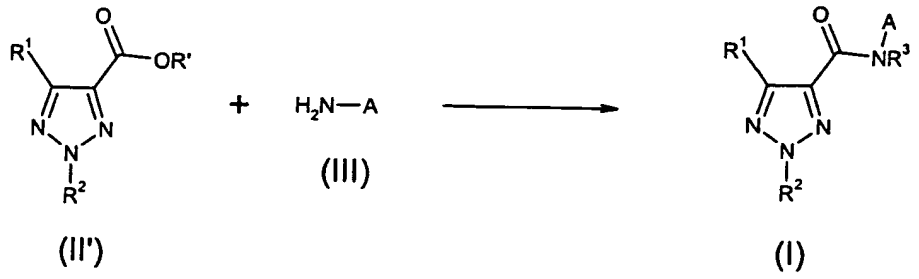


(VIII)

[其中R'[a]為氫或甲基]，其係藉由將Simmons Smith反應(Zn-Cu，CH_2I_2，溶劑為乙醚)施用於式(VII)化合物之烯烴基上，獲得式(VIII)之化合物。式(VIII)化合物之硝基基團還原成式(IIIc)之化合物可使用上述式(VI)化合物之相同條件進行。

(c) 式(I)化合物之製備

反應圖5

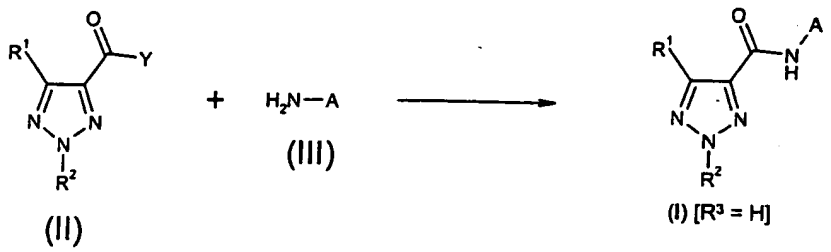


(II')　　(III)　　(I)

式(I)化合物[其中A、R^1及R^2之定義均如上，且R^3為H]可

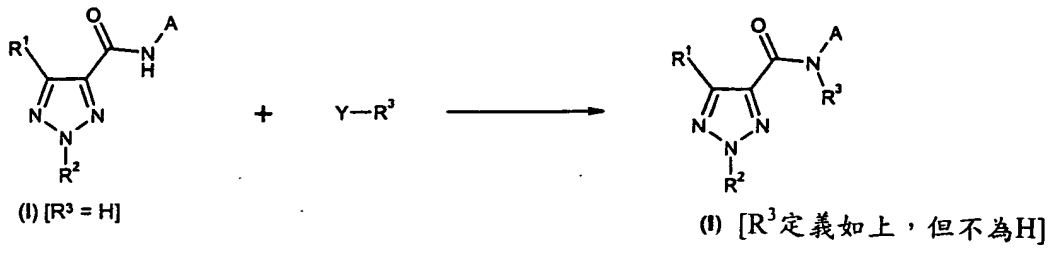
藉由使式(II')之化合物[其中R^1及R^2定義均如上，且R'為C_{1-4}烷基]與式(III)之苯胺[其中A定義如上述式(I)化合物之定義]，在$NaN(TMS)_2$存在及-10℃至周圍溫度下，，且較好在無水THF中，如J. Wang等人, Synlett, 2001, 1485所述反應合成。

反應圖6



或者，式(I)之化合物[其中A、R^1及R^2定義如上，且R^3為H]可藉由使式(II)之化合物[其中R^1及R^2之定義均如上，且Y為OH]與式(III)之化合物[其中A之定義如上述式(I)之化合物]，在活化劑[如BOP-Cl]及二當量鹼[如NEt_3]存在下反應，或藉由使式(II)之化合物[其中Y為Cl、Br或F]與式(III)之化合物在一當量鹼[如NEt_3、$NaHCO_3$、$KHCO_3$、Na_2CO_3或K_2CO_3]存在下，於溶劑[如二氯甲烷、乙酸乙酯或DMF]中，且較好在-10至30℃下反應製備。

反應圖7



式(I)之化合物[其中R^3之定義如上述式(I)之定義，但不為

氫]可藉由使式(I)之化合物[其中R^3為氫]與物種Y-R^3 [其中R^3之定義如式(I)之定義，但不為氫，且Y為鹵素，較好為Cl、Br或I；或Y為使得Y-R^3為酸酐；亦即當R^3為COR*時，Y為OCOR*]，在鹼[例如NaH、NEt_3、$NaHCO_3$或K_2CO_3]存在下，於適當溶劑[如乙酸乙酯]或於雙相混合物[如二氯甲烷/水混合物]中，在-10至30℃下反應製備。

意外的，如今已經發現式(I)之新穎化合物實務上具有極有利之活性圖譜，以對抗因真菌以及細菌與濾過性病毒造成之疾病。

式(I)之化合物可用於農業區域及用作活性成分以控制植物昆蟲之相關領域。新穎之化合物係以低之使用率下極佳之活性，且可為植物可忍受及在環境上安全下區分。其具有及有用之治療、預防及系統性質，且可用於保護許多耕種之植物。式I之化合物可用於抑制或破壞在有用作物之不同穀物枝植物或植物之部分(水果、花、葉、莖、塊莖、根部)上產生之害蟲，且亦可保護後來生長之植物部分，例如由植物病蟲害之微生物部分。

亦可使用式(I)之化合物當作處理作物繁殖材料用之填充劑，尤其是種子(水果、塊莖、穀粒)及切割下之作物(例如稻米)，以保護免於真菌之感染以及免於土壤中造成之植物病蟲害真菌。

另外，本發明之化合物可用於控制相關區域中之真菌，例如用於技術材料之保護，包含木材及木材相關之技術性產物，用於食品之儲存、衛生管理等。

式(I)之化合物可例如有效的對抗以下類型之植物病蟲害真菌：不完全真菌類(Fungi imperfecti)(例如灰黴病菌(Botrytis)、稻熱病菌(Pyricularia)、玉米煤紋病菌(Helminthosporium)、莖基部受到鐮胞菌(Fusarium)、葉枯病(Septoria)、星辰花葉斑病(Cercospora)及鏈格菌(Alternaria))及擔子菌門(Basidiomycetes)(例如立枯絲核菌(Rhizoctonia)、咖啡葉鏽病(Hemileia)、金針銹病(Puccinia))。另外，其亦可有效的對抗子囊菌綱(Ascomycetes)類(例如，蘋果黑星病菌(Venturia)及穀類白粉病(Erysiphe)、梅白粉病(Podosphaera)、樟樹葉枯病(Monilinia)、葡萄白粉病(Uncinula))以及卵菌(Oomycetes)類(例如疫菌(Phytophthora)、腐霉菌(Pythium)、葡萄霜霉病(Plasmopara))。已經發現可對抗白粉菌屬(Erysiphe spp.)之顯著活性。另外，式I之新穎化合物可有效的對抗植物病蟲害細菌及濾過性病毒(例如對抗黃單孢菌(Xanthomonas spp)、假單胞菌屬(Pseudomonas spp)、蘋果火疫病菌(Erwinia amylovora)以及對抗菸草馬賽克病毒)。

本發明之範圍中，欲保護之標度穀物一般包括以下類型之作物：股類植物(小麥、大麥、裸麥、燕麥、稻米、玉米、高粱及相關作物)；甜菜(製糖用甜菜及飼料用甜菜)；梨果、核果及柔軟水果(蘋果、梨子、梅子、桃子、杏仁、櫻桃、草莓、覆盆子及黑莓)；豆科作物(豆實、扁豆、蜿豆、大豆)；油脂作物(油菜、芥子、罌粟、橄欖、向日葵、椰子、蓖麻油植物、可可豆、落花生)；胡瓜作物(南瓜、黃瓜、

甜瓜)；纖維性作物(棉、亞麻、大麻、黃麻)；柑類水果(橘子、檸檬、葡萄柚、柑桔)；蔬菜(菠菜、萵苣、蘆筍、甘藍菜、胡蘿蔔、洋蔥、蕃茄、馬鈴薯、辣椒)；月桂科(梨、月桂、樟腦)或作物如煙草、核果、咖啡、茄子、甘蔗、茶、胡椒、葡萄樹、香蕉及天然橡膠作物，以及觀賞植物。

式(I)之化合物係以未經改質之形式使用，或較好伴隨調配物之技藝中慣用之佐藥使用。因此較好依已知方式調配成可乳化濃縮物、可塗佈糊料、可直接噴不或可稀釋之溶液、稀釋乳液、可潤濕粉末、可溶粉末、粉塵、細顆粒、以及例如聚合物物質中之膠囊。若為組合物之類型，則施用之方法如噴霧、霧化、粉塵化、分散、塗佈或傾倒均依據預期之標的及主要環境選用。組合物亦可含另一種佐藥如安定劑、消泡劑、黏度調節劑、結合劑、或黏稠賦予劑以及肥料、微量營養劑受體或其他用於獲得特殊作用之調配物。

適用之載劑及佐藥可為固體或液體，且為調配技術中所用之物質，例如天然或再生之之礦物質、溶劑、分散劑、潤濕劑、黏稠賦予劑、結合劑或肥料。該載劑例如敘述於WO 97/33890中。

式(I)之化合物通常以組合物之形式使用，且可施用於作物之區域或欲處理之作物上，同時或與其他化合物連續施用。其他化合物可為例如肥料或微量營養素受體或影響作物成長之其他製劑。其亦可為選用之除草劑以及殺蟲劑、殺真菌劑、殺菌劑、殺圓蟲劑、殺軟體動物劑或數種此等

製劑之混合物，且若需要可與其他載劑、界面活性劑或施用調配物技藝中慣用之促進用佐藥併用。

式(I)之化合物可與殺真菌劑混合，使之在某些情況下具有綜效活性。最好為唑系之混合成分如氮雜康唑(azaconazole)、BAY 14120、必特醇(bitertanol)、泊努康唑(bromuconazole)、析譜康唑(cyproconazole)、第吩康唑(difenoconazole)、第尼康唑(diniconazole)、環氧康唑(epoxiconazole)、吩必康唑(fenbuconazole)、夫坤康唑(fluquinconazole)、夫析唑(flusilazole)、夫三浮(flutriafol)、六康唑(hexaconazole)、咪雜(imazalil)、咪扁康唑(imiben-conazole)、依康唑(ipconazole)、面康唑(metconazole)、米克必塔(myclobutanil)、比夫祚(pefurazoate)、偏康唑(penconazole)、比理吩克(pyrifenox)、譜克(prochloraz)、譜皮康唑(propiconazole)、析美康唑(simeconazole)、帖必康唑(tebuconazole)、四康唑(tetraconazole)、三第峰(triadimefon)、三第免醇(triadimenol)、三夫咪唑(triflumizole)、三悌康唑(triticonazole)、嘧啶基卡必諾(pyrimidinyl carbinole)，如蒽析嘧醇(ancymidol)、吩理醇(fenarimol)、納理醇(nuarimol)、2-胺基嘧啶如必派理(bupirimate)、第美理醇(dimethirimol)、以理醇(ethirimol)；嗎啉如朵第磨(dodemorph)、夫譜皮啶(fenpropidine)、吩譜皮磨(fenpropimorph)、匹羅胺(spiroxamine)、三第磨(tridemorph)；苯胺基嘧啶如析譜第尼(cyprodinil)、美帕理(mepanipyrim)、比美沙尼(pyrimethanil)；比唑如吩皮克里(fenpiclonil)、夫第氧里(fludioxonil)；苯

基醯胺如編拉析(benalaxyl)、夫拉析(furalaxyl)、偏拉析(metalaxyl)、R-偏拉析(R-metalaxyl)、歐夫雷(ofurace)、氧雜二析(oxadixyl)；苯併咪唑如編羅米(benomyl)、卡編噠井(carbendazim)、第貝卡(debacarb)、夫備噠唑(fuberidazole)、塞編噠唑(thiabendazole)；二羧基亞醯胺如克唑里(chlozolinate)、二氯唑啉(dichlozoline)、依普酮(iprodione)、米克唑啉(myclozoline)、普析米酮(procymidone)、惟克唑啉(vinclozoline)；羧醯胺如卡泊辛(carboxin)、吩夫南(fenfuram)、夫妥尼(flutolanil)、美普尼(mepronil)、氧基卡播辛(oxycarboxin)、析夫雜醯胺(thifluzamide)；胍啶如瓜雜汀(guazatine)、多啶(dodine)、咪羅塔啶(iminoctadine)；拖必魯里(strobilurines)如偶氮氧基拖必(azoxystrobin)、雷梭析-甲基(kresoxim-methyl)、美拖米-羅司拖必(metominostrobin)、SSF-129、三浮拖必(trifloxystrobin)、匹可拖必(picoxystrobin)、BAS 500F(名稱為比雷克拖比(pyraclostrobi)，BAS 520；二瘤代胺基甲酸酯如芙卞(ferbam)、免可雜(mancozeb)、免聶(maneb)、美悌藍(metiram)、普皮聶(propineb)、塞藍(thiram)、及聶(zineb)、及藍(ziram)；N-鹵基甲基硫代四氫汰亞醯胺如克塔夫(captafol)、克坦(captan)、二氯芙賣(dichlofluanid)、氟賣(fluoromides)、夫配(folpet)、脫里芙賣(tolyfluanid)；Cu-化合物如Bordeaux混合物、氫氧化銅、氧基氯化銅、硫酸銅、氧化銅、mancopper,8-羥基奎啉-銅；硝基酚衍生物如第諾卡(dinocap)、硝基硫醇-異丙基；有機-p-衍生物如依第分普(edifenphos)、依普編

普(iprobenphos)、異普硫茂烷(isoprothiolane)、芙第分(phosdiphen)、比祚普(pyrazophos)、脫克服-甲基(tolclofos-methyl)；各種其他物種如析扁祚雷-S-甲基(acibenzolar-S-methyl)、尼拉井(anilazine)、編析凡卡(benthiavalicarb)、雷悌析丁-S(blasticidin-S)、析羅美塞(chinomethionate)、氯聶(chloroneb)、氯莎羅里(chlorothalonil)、析芙分賣(cyflufenamid)、析默思里(cymoxanil)、第克龍(dichlone0、第克美井(diclomezine)、第克蘭(dicloran)、第索分卡(diethofencarb)、第美索磨(dimethomorph)、SYP-LI90(名稱：芙磨(flumorph))、第塞諾(dithianon)、依莎泊山(ethaboxam)、依汰第唑(etridiazole)、非莫塞酮(famoxadone)、分嚀酮(fenamidone)、分諾塞里(fenoxanil)、分汀(fentin)、非里棕(ferimzone)、芙己藍(fluazinam)、夫硫醯胺(flusulfamide)、分六麥(fenhexamid)、夫析基-鋁(fosetyl-aluminium)、美唑(hymexazol)、依普里卡(iprovalicarb)、IKF-916(析雜麥(cyazofamid))、卡雜黴素(kasugamycin)、美莎硫卡(methasulfocarb)、偏非酮(metrafenone)、尼可必分(nicobifen)、盤析克龍(pencycuron)、苯汰、聚8-羥基奎啉、普苄唑(probenazole)、普帕莫卡(propamocarb)、比洛奎龍(pyroquilon)、奎洛非(quinoxyfen)、奎拓井(quintozene)、硫、三偶氮氧化物環唑(triazoxide cyclazole)、三芙里(triforine)、凡達黴素(validamycin)、柞醯胺(zoxamide)(RH7281)。

施用式(I)化合物或含該等化合物之至少一種之農業用組合物之較佳方法為施加於葉上。施用頻度及及施用速率將

依相對應病原體之侵襲風險而定。然而，式I之化合物亦可藉由以液態調配物始作物所在地濕潤，或藉由將土壤態化合物加於土壤中，例如細顆粒形式(土壤塗佈)，經由土壤之根部滲入作物中(合成作用)。水稻作物中，可將該系粒加於灌溉之稻田中。式I之化合物亦可藉由以殺真菌劑之液態調配物滲入種子或塊莖中，或以固態調配物將其塗覆施用於種子(塗覆)中。

調配物[亦即含式(I)化合物之組合物]及若需要之固態或液態佐劑係依已知方式製備，且一般係藉由使化合物與延展劑例如溶劑、固態載劑及選用之表面活性化合物(界面活性劑)均勻的混合及/或輾磨製備。

農業用化學調配物通常含0.1至99 wt%，較好0.1至95 wt%之式I化合物，99.9至1 wt%，較好99.8至5 wt%之固體或液態佐劑，及0至25 wt%，較好0.1至25 wt%之界面活性劑。

施用之較佳速率一般為每公畝(ha)5克至2公斤活性成分(a.i.)，較好為10克至1公斤a.i./ha，最好為20克至600克a.i./ha。當使用種子潤濕劑時，一般劑量為每公斤種子10毫克至1克之活性物質。

因此，較好將化學產物調配成濃縮液，最終使用者一般或使用稀釋之調配物。

以下非限制用實例更詳細說明上述之方法。

實例1

該實例說明化合物編號1.15 [2-甲基-5-三氟甲基-2H-1,2,3-三唑-4-羧酸甲酯]及化合物編號1.13[2-甲基-5-三

氟甲基-2H-1,2,3-三唑-4-羧酸]之製備。

a) 2-甲基-2H-1,2,3-三唑-4,5-二羧酸二甲酯及1-甲基-1H-1,2,3-三唑-4,5-羧酸二甲酯之製備

使1,2,3-三唑-4,5-二羧酸二甲酯(Y. Tanaka等人, Tetrahedron 29, 3271 (1973)) (74.06克，0.40莫耳)、碳酸鉀(110.57克，0.80莫耳)及碘化鉀(73.81克，0.52莫耳)在乙腈(1000毫升)中，40℃下攪拌20分鐘，接著在周圍溫度下攪拌20小時。將混合物倒入冰-水中，且以乙醚萃取，獲得異構物混合物之粗產物(70.66克)。在矽膠上以乙酸乙酯-己烷(2：3)分離，獲得36.51克(46%)2-甲基-2H-1,2,3-三唑-4,5-二羧酸二甲酯[m.p. 86-87℃; ^{1}H-NMR (300 MHz, DMSO-d_6), δ(ppm): 4.27 (s, 3H), 3.88 (s,6H)]；及26.92克(34%) 1-甲基-1H-1,2,3-三唑-4,5-二羧酸二甲酯[m.p. 63-64°C; ^{1}H-NMR (300 MHz, DMSO-d_6), δ (ppm): 4.19 (s, 3H), 3.93 (s, 3H), 3.87 (s,3H)]。

b) 2-甲基-2H-1,2,3-三唑-4,5-二羧酸單甲酯之製備

於含2-甲基-2H-1,2,3-三唑-4,5-二羧酸二甲酯(1.2克，6毫莫耳)之30毫升甲醇溶液中添加358毫克KOH(分析86%，5.5毫莫耳)。混合物於回流溫度下加熱48小時。蒸發溶劑，再將殘留物置於水中且以乙酸乙酯(3次)萃取。合併之有機相含未反應之起始物質。水相以2N HCl (pH 2-3)酸化，且以乙酸乙酯萃取(3次)。合併萃取液，經脫水(無水$MgSO_4$)且蒸發至乾，獲得803毫克(72%)所需化合物(m. p. 125-126°C; ^{1}H-NMR (300 MHz, DMSO-d_6), δ(ppm): 13.7 (br.s, 1H, 可以

D_2O交換), 4.24 (s, 3H), 3.84 (s, 3H)。

c) 2-甲基-5-三氟甲基-2H-1,2,3-三唑-4-羧酸甲酯[化合物編號1.15]

將2-甲基-2H-1,2,3-三唑-4,5-二羧酸單甲酯(2.9克，15.66毫莫耳)及二氯甲烷(160毫升)置於0.31升monel高壓釜中。在惰性氣體中且以乾冰冷卻下，於-50℃下加入氣態HF (27克)，接著加入氣體SF4 (經蒸餾，6.9克，64.23毫莫耳)。將高壓釜加熱至80℃ 6小時。最大壓力量為9.8bar。冷卻至周圍溫度後，將反應混合物倒入冰冷-二氯甲烷中，且以$NaHCO_3$水溶液調整至pH 7。以二氯甲烷萃取(3次)，以Na_2SO_4脫水，且減壓蒸發，獲得粗產物。以Kugelrohr-蒸餾，在3毫巴及約180℃下純化，獲得2.8克(85%)黃色液態化合物編號1.15。

^{1}H-NMR (300 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm): 4.29 (s, 3H), 3.97 (s, 2H);

^{19}F-NMR (235 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm): -61.7。

^{13}C-NMR (125 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm):159.05, 139.65 (q, $J_{C(5)F}$=40.8 Hz), 137.20, 119.63 (q, J_{CF}=269.4 Hz, CF_3), 52.96, 43.01。

d) 2-甲基-5-三氟甲基-2H-1,2,3-三唑-4-羧酸[化合物編號1.13]

在回流下加熱含2-甲基-5-三氟甲基-2H-1,2,3-三唑-4-羧酸甲酯[化合物編號1.15](2.09克-0.01莫耳)及KOH (86% 0.783克1.2當量)之THF (50毫升)溶液3.5小時。蒸發溶液且

將殘留物溶於水中且以HCl (1M)酸化至pH 1-2。蒸發水溶液接著以乙酸乙酯連續萃取20小時，獲得結晶固態化合物編號1.13 (2.11克，100%)。

^{1}H-NMR (400 MHz, DMSO-d_6), δ(ppm): 4.19 (s, 3H)。

^{19}F-NMR (235 MHz, DMSO-d_6), δ(ppm): -59.3。

^{13}C-NMR (125 MHz, DMSO-d_6), δ(ppm):160.74, 144.08 135.81 (q, $J_{C(5)F}$=38.1 Hz), 120.63 (q, J_{CF}=268.4 Hz, CF_3), 42.20。

實例2

該實例說明化合物編號1.03 [2-甲基-5-二氟甲基-2H-1,2,3-三唑-5-羧酸甲酯]之製備。

a) 5-氯羰基-2-甲基-2H-1,2,3-三唑-4-羧酸甲酯之製備

在20℃下，於二氯甲烷(20毫升)中使2-甲基-1,2,3-三唑-4,5-二羧酸甲酯(2.3克，0.011莫耳)與草醯氯(1.46毫升，0.014莫耳)加上二滴DMF反應。當劇烈反應終止時，使溫度上升至回流15小時。使混合物蒸發至乾，獲得2.7克固態酸性氯化物。^{1}H-NMR (300 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm): 4.48 (s, H), 4.0 (s, 3H)。

b) 5-甲醯基-2-甲基-2H-1,2,3-三唑-4-羧酸甲酯之製備

於含新製備5-氯羰基-2-甲基-2H-1,2,3-三唑-4-羧酸甲酯(2.7克，約13毫莫耳)之THF (270毫升)溶液中添加乙基-二異丙基胺(1.88克，1.1當量)。混合物在2.7克10% Pd/C存在下，於0-5℃及一般壓力下氫化2.5小時，接著自觸媒過濾。蒸發透明溶液，獲得固態粗產物，再度將其溶於乙酸乙酯中

且與矽膠攪拌2分鐘。過濾且蒸發後，獲得1.77克(84%)灰白色結晶狀純產物。[m.p. 107-108℃; ^{1}H-NMR (300 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm): 10.43 (s, 1H), 4.33 (s, 3H), 4.01 (s, 3H)]。

c) 2-甲基-5-二氟甲基-2H-1,2,3-三唑-5-羧酸甲酯[化合物編號1.03]之製備

在周圍溫度至50℃下，使5-甲醯基-2-甲基-2H-1,2,3-三唑-4-羧酸甲酯(600毫克，3.5毫莫耳)於0.5毫升$CHCl_3$中與(雙(2-甲氧基乙基)胺基)硫三氟(1350毫克，6.1毫莫耳)反應6天。所得橘色溶液以6毫升飽和$NaHCO_3$水溶液小心終止反應(劇烈反應)，且以乙酸乙酯萃取(二次)。合併之有機相以$NaHCO_3$水溶液洗滌，以無水$MgSO_4$脫水且蒸發，獲得351毫克(52%)無色結晶。

^{1}H-NMR (300 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm): 7.15 (t, J_{HF}=53.5 Hz, 1H, H-CF_2), 4.30 (s, 3H), 3.98 (s, 3H); ^{19}F-NMR (235 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm): -116.1; ^{13}C-NMR (125 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm): 160.0, 143.6 (t, $J_{C(5)F}$=25.6 Hz), 137.2, 108.0 (t, $J_{(CF)}$=237.8 Hz, CHF_2), 52.6, 42.7]。

實例3

該實例說明化合物標號1.50[2-甲基-5-氟甲基-2H-1,2,3-三唑-5-羧酸甲酯]之製備

a) 5-羥基甲基-2-甲基-2H-1,2,3-三唑-4-羧酸甲酯之製備

在周圍溫度及攪拌下以$NaBH_4$ (601毫克)處理含2.6克(13.3毫莫耳) 5-甲醯基-2-甲基-2H-1,2,3-三唑-4-羧酸甲酯(見實例2a)之甲醇(100毫升)。反應混合物以飽和氯化鈉水溶液終

止反應，以乙酸乙酯萃取，以Na_2SO_4脫水且蒸發，獲得油狀粗產物。在矽膠上以乙酸乙酯：己烷(2：1)純化，獲得1.85克(81%)結晶產物。m.p.112-113℃。

^{1}H-NMR (300 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm): 4.86 (d, J=6.9 Hz, 1H), 4.22 (s, 3H), 3.98 (s, 3H), 3.53 (t; J=6.9 Hz, 可與D_2O交換)。

b) 2-甲基-5-氟甲基-2H-1,2,3-三唑-5-羧酸甲酯[化合物編號1.50]之製備

在-40℃下使含5-羥基甲基-2-甲基-2H-1,2,3-三唑-4-羧酸甲酯(200毫克，1.1毫莫耳)之CH_2Cl_2 (15毫升)溶液與0.26毫升三氟化二乙基胺基硫(2毫莫耳)反應15分鐘，接著在周圍溫度下反應15小時。蒸發後，粗產物在矽膠上以乙酸乙酯：己烷(3：1)純化，獲得181毫克(95%)所需產物，m.p.64-66℃。

^{1}H-NMR (300 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm): 5.66 (d, J_{HF}=47.5 Hz, 2H, H_2-CF), 4.26 (s, 3H), 3.96 (s, 3H)。

^{19}F-NMR (235 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm): -214。

^{13}C-NMR (125 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm): 161.6, 145.86 (d, $J_{C(5)F}$=18.7 Hz), 137.09, 74.82 (d, J_{CF}=166.6 Hz, CH_2F), 52.2, 42.3。

實例4

該實例說明化合物編號3.017 [5-二氟甲基-2-甲基-2H-1,2,3-三唑-4-羧酸(4'-氯-聯苯-2-基)-醯胺]。

在攪拌下以注射將雙(三甲基矽烷基)-醯胺(0.88毫升，THF中2M；1.76毫莫耳，1.12當量)添加於含2-己基-5-二氟

甲基-2H-1,2,3-三唑-5-羧酸甲酯(300毫克，1.57毫莫耳)及4'-氯-聯苯-2-基胺(320毫克；1.57毫莫耳)之THF (3毫升)溶液中。反應混合物在0℃下攪拌15分鐘，接著在周圍溫度下攪拌22小時。接著倒在冷卻之飽和NH_4Cl溶液中，且以乙酸乙酯萃取。以食鹽水洗滌後，經脫水(無水$MgSO_4$)且蒸發至乾，獲得固體，再分散於己烷中。無色結晶產物經過濾且乾燥：30毫克(53%)[m.p. 155-156℃；1H-NMR (300 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm): 8.5 (br,可與D_2O交換, 1H), 8.4 (d, 1H), 7.5-7.2 (m, 7H), 7.38 (t, J_{HF}=52.5 Hz, 1H, CHF_2), 4.2 (s, 3H), LC-MS: 363 (M+H)]。

實例5

該實例說明化合物編號2.219 [2-甲基-5-三氟甲基-2H-1,2,3-三唑-4-羧酸[2-(1,3-二甲基-丁基)-苯基]-醯胺]之製備。

在周圍溫度下以注射將雙(三甲基矽烷基)-醯胺(0.638毫升，THF中2M，1.7當量)添加於含2-甲基-5-三氟甲基-2H-1,2,3-三唑-4-羧酸甲酯(150毫克，0.75毫莫耳)及2-(1.3-二甲基-丁基)-苯基醯胺(133毫克，0.75毫莫耳)之溶液中。使反應混合物攪拌20小時，接著倒入冷卻之飽和NH_4Cl溶液中，且以乙酸乙酯萃取。以食鹽水洗滌後，經脫水(無水$MgSO_4$)且蒸發至乾，獲得粗產物，其於矽膠上以環己烷-乙酸乙酯(18：1)純化。將結晶產物分散於己烷中，經過濾且真空乾燥，獲得130毫克(40%)化合物編號2.219 [MP 94.6-95.4℃；1H-NMR (300 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm): 8.5 (br. s,

可與D_2O交換，1H), 8.0 (d, 1H), 7.3-7.15 (m, 3H), 4.33 (s, 3H), 3.0 (m, 1H), 1.55-1.35 (m, 3H), 1.26 (d, 3H), 0.9 (2d, 6H); LC-MS: 355.6 (M+H)]。

實例6

該實例說明化合物編號26.014[1,8-二甲基-1-氧雜-三環并[6.2.1.0*2.7]十一烷-2,4,6-三烯-3-基-醯胺]。

在RaNi (1.1克)存在及周圍溫度下，使含1,4-二甲基-5-硝基-1,4-二氫-1,4-環氧萘(5.49克，25.27毫莫耳)(見T. Nishiyama等人, Rikagaku-hen, 28, 37-43 (2000))之55毫升THF溶液氫化。18小時後釋出之氫氣為2.23升(97%)。過濾觸媒後，蒸發濾液且置於乙醚中，以$NaHCO_3$水溶液洗滌且脫水(Na_2SO_4)，獲得4.60克油狀粗產物。分散於己烷中且去除微量乙醚，獲得4.5克(94%)紅色結晶產物，m.p. 92-93℃。

^{1}H-NMR (300 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm): 7.05 (t, 1H), 6.7 (t, 2H), ca.5 (br., 可與D_2O交換, 2H), 2.0 (s, 3H), 1.9 (m, 2H), 1.8 (s, 3H), 1.7 (m, 1H), 1.5 (m, 1H)。

實例7

該實例說明化合物編號26.001 [1,8-二甲基-11氧雜-三環并[6.2.1.0*2.7]十一烷-2,4,6,9-四烯-3-基-胺]之製備。

在47℃下，於含1,4-二甲基-5-硝基-1,4-二氫-1,4-環氧萘(4.22克，19.43毫莫耳)(見實例6)之乙醇(60毫升)中添加含氯化銨(2.08克)之H_2O (5.2毫升)溶液。劇烈緻拌下於5分鐘內逐步添加鋅粉(9.10克，0.14莫耳)。懸浮液加熱至回流5.5小時，接著經Hyflo™過濾，獲得透明黃色濾液。蒸發後，獲

得4.57克黏稠油狀物粗產物。在矽膠上以乙酸乙酯-己烷(1：4)管柱層析，獲得1.24克(34%)棕色結晶所需產物。m.p.92-96℃。

^{1}H-NMR (300 MHz, $CDCl_3$), δ(ppm): 6.85及6.7 (two m, 2x2H), 6.47 (t, 1H), ca.5-3 (br., 可與D_2O交換, 2H), 2.07 (s, 3H), 1.85 (s, 3H)。

式(I)化合物之調配物實例

製備式I化合物調配物之操作程序如乳化、濃縮、溶液、顆粒、粉塵及可潤濕粉末均敘述於WO 97/33890中。

生物實例：殺真菌活性

實例B-1：對小麥葉銹菌(Puccinia reconditea)/小麥(小麥棕霉)之作用

1週齡小麥植物(Arina種)以在噴霧室中之經調配之試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用1天後，小麥植物藉噴霧孢子懸浮液(1 x 10^5尿素孢子/毫升)在試驗植物上而接種。在20℃及95% r.h.培育2小時後，植物保持在20℃及60% r.h.之溫室中8天。接種10天後評估疾病發生。

各以化合物2.273、3.219、3.273、3.321、8.189、9.189、20.017、20.022、21.017及21.022實際上完全避免傳染(0-5%傳染率)。

實例B-2:對頻果白粉霉(Podosphaera leucotricha)/蘋果(蘋果白粉霉)之作用

5週齡蘋果幼苗(McIntosh種)以在噴霧室中之經調配試驗化合物(0.02%活性成分)處理。隔天，施用之蘋果植物藉搖晃

植物在試驗植物上以頻果白粉霉傳染。在22℃及60% r.h.以14/10小時(亮/暗)照光過程培育12小時後，評估疾病發生。

化合物2.005、3.017、3.219及9.189各展現強效力(<20%傳染)。

實例B-3：對蘋果黑星菌(Venturia inaequalis)蘋果(蘋果上之斑點病)之作用

4週齡蘋果幼苗(McIntosh種)以在噴霧室中之經調配試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用隔天，蘋果植物藉由在試驗植物上噴霧孢子懸浮液(4 x 10^5分出孢子/毫升)接種。在21℃及95% r.h.培育4天後，植物在21℃及60% r.h.溫室中4天。在21℃及95% r.h.又培育4天後，評估疾病發生。

化合物3.017、3.219及9.189各展現強效力(<20%傳染)。

實例B-4：對麥類白粉菌(Erysiphe graminis)/大麥(大麥上之粉霉)作用

1週齡大麥植物(Regina種)以在噴霧室中之經調配試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用隔天，大麥植物在試驗植物上藉搖晃粉霉感染植物而接種。在22℃/18℃(白天/黑夜)及60% r.h.於溫室中培育6天後，評估疾病發生。

化合物2.017、2.029、2.273、3.005、3.017、3.029、3.067、3.070、3.219、3.273、3.321、3.407、8.189、9.189及21.017各展現強效力(<20%傳染)。

實例B-5：對柑桔灰霉菌(Botrytis cinerea)/葡萄(葡萄上之灰黴菌)之作用

5週齡葡萄幼苗(Gutedel種)以在噴霧室中之經調配試驗

化合物(0.02%活性成分)處理。施用後2天，葡萄植物藉由在試驗植物上噴霧孢子懸浮液(1 x 10^6分出孢子/毫升)接種。在21℃及95% r.h.於溫室培育4天後，評估疾病發生。

化合物2.029、3.017及3.219在該試驗中各展現良好活性(<50%疾病發生率)。

實例B-6：對柑桔灰霉菌(Botrytis cinerea)/蕃茄(蕃茄上之灰黴菌)之作用

4週齡蕃茄幼苗(Roter Gnom種)以在噴霧室中之經調配試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用後2天，蕃茄植物藉由在試驗植物上噴霧孢子懸浮液(1 x 10^5分出孢子/毫升)接種。在20℃及95% r.h.於生長室中培育4天後，評估疾病發生。

化合物2.029、3.005、3.029、3.067、3.070、3.219、3.273、9.189及20.017各展現良好活性(<50%疾病發生率)。

實例B-7：對小麥穎枯菌(Septoria nodorum)/小麥(小麥上之穎枯菌葉斑)作用

1週齡小麥植物(Arina種)以在噴霧室中之經調配試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用後隔天，小麥植物藉由在試驗植物上噴霧孢子懸浮液(5 x 10^5分出孢子/毫升)接種。在20℃及95% r.h.培育1天後，植物置於20℃及60% r.h.之溫室中維持10天。接種後11天評估疾病發生。

化合物3.273及9.189在該試驗中各展現良好活性(<50%疾病發生率)。

實例B-8：對大麥網斑菌(Helminthosporium teres)/大麥(大麥上之淨污點)作用

1週齡大麥植物(Regina種)以在噴霧室中之經調配試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用後2天，大麥植物藉由在試驗植物上噴霧孢子懸浮液(3 x 10^4分出孢子/毫升)接種。在20℃及95% r.h.之溫室中培育4天後，評估疾病發生。

化合物2.005、2.017、2.029、2.067、2.070、2.273、3.005、3.017、3.029、3.067、3.070、3.219、3.407、9.189及21.017在該試驗中各展現良好活性(<20%疾病發生率)。

實例B-9：對辣椒白星菌(Alternaria solani)/蕃茄(蕃茄上之早期枯萎)作用

4週齡蕃茄植物(Roter Gnom種)以在噴霧室中之經調配試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用後2天，蕃茄植物藉由在試驗植物上噴霧孢子懸浮液(2 x 10^5分出孢子/毫升)接種。在20℃及95% r.h.之生長室中培育3天後，評估疾病發生。

化合物2.005、2.029、3.005、3.017、3.029及9.189在該試驗中各展現良好活性(<20%疾病發生率)。

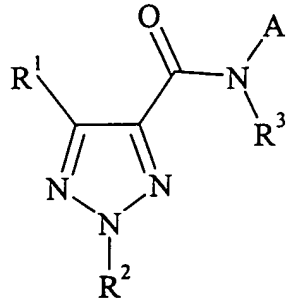
實例B-10：對葡萄白粉菌(Uncinula Necator)/葡萄(葡萄上之粉霉)作用

5週齡葡萄幼苗(Gutedel種)以在噴霧室中之經調配試驗化合物(0.02%活性成分)處理。施用後隔天，葡萄植物藉由在試驗植物上搖晃葡萄粉霉感染植物而接種。在26℃及60% r.h.以14/10小時(亮/暗)之照光處理7天培育後，評估疾病發生。

化合物3.017、3.219及9.189在該試驗中各展現良好活性(<20%疾病發生率)。

伍、中文發明摘要：

一種式(I)之化合物



(I)

其中A為選自許多特定環之鄰-取代環；

R^1為鹵素、氰基、硝基、C_{1-4}-烷基、C_{1-4}鹵烷基、C_{1-4}烷氧基或C_{1-4}鹵烷氧基或視情況取代之C_{2-4}烯基，視情況取代之C_{2-4}炔基或視情況取代之$SO_2(C_{1-4})$烷基(其中視情況取代之基團各具有至多3個取代基，且各獨立選自鹵素及C_{1-4}烷氧基)；

R^2為C_{1-4}烷基、C_{1-4}鹵烷基、C_{1-4}烷氧基(C_{1-4})烷基或C_{1-4}烷基硫基(C_{1-4})烷基或[視情況取代之芳基](C_{1-4})烷基-，或[視情況取代之芳基]氧基(C_{1-4})烷基(其中視情況取代之芳基基團各具有至多3個取代基，且各獨立選自鹵素及C_{1-4}烷氧基)；

R^3為氫、$CH_2C{\equiv}CR^4$、$CH_2CR^4{=}C(H)R^4$、$CH{=}C{=}CH_2$或COR^5，或視情況取代之C_{1-4}烷基，視情況取代之C_{1-4}烷氧基或視情況取代之(C_{1-4})烷基C(=O)O(其中視情況取代之基團各具有至多3個取代基，且各獨立選自鹵素及C_{1-4}烷氧基、C_{1-4}烷基、C_{1-2}鹵烷氧基、羥基、氰基、羧基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、甲基磺醯基及乙基磺醯基)；

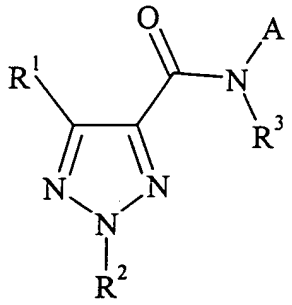
各R^4係獨立為氫、鹵素、C_{1-4}烷基、C_{1-4}鹵烷基、C_{1-4}烷氧基

、或C_{1-4}烷氧基(C_{1-4})烷基；及

R^5為氫或視情況取代之C_{1-6}烷基、視情況取代之C_{1-4}烷氧基、視情況取代之C_{1-4}烷氧基(C_{1-4})烷基、視情況取代之C_{1-4}烷基硫基(C_{1-4})烷基或視情況取代之芳基(其中視情況取代之基團各具有至多3個取代基，且各獨立選自鹵素、C_{1-6}烷氧基、C_{1-6}鹵烷氧基、氰基、羥基、甲氧基羰基及乙氧基羰基)。

陸、英文發明摘要：

A compound of formula (I):



(I)

where A is an *ortho*-substituted ring selected from a number of specified rings;

R^1 is halogen, cyano, nitro, C_{1-4} alkyl, C_{1-4} haloalkyl, C_{1-4} alkoxy or C_{1-4} haloalkoxy or optionally substituted C_{2-4} alkenyl, optionally substituted C_{2-4} alkynyl or optionally substituted $SO_2(C_{1-4})$alkyl (where the optionally substituted moieties may each have up to 3 substituents, each independently selected from halogen and C_{1-4} alkoxy);

R^2 is C_{1-4} alkyl, C_{1-4} haloalkyl, C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})alkyl or C_{1-4} alkylthio(C_{1-4})alkyl or [optionally substituted aryl](C_{1-4})alkyl- or [optionally substituted aryl]oxy(C_{1-4})alkyl- (where the optionally substituted aryl moieties may each have up to 3 substituents, each independently selected from halogen and C_{1-4} alkoxy);

R^3 is hydrogen, $CH_2C{\equiv}CR^4$, $CH_2CR^4{=}C(H)R^4$, $CH{=}C{=}CH_2$ or COR^5 or optionally substituted C_{1-4} alkyl, optionally substituted C_{1-4} alkoxy or optionally substituted (C_{1-4}) alkylC(=O)O (where the optionally substituted moieties may each have up to 3 substituents, each independently selected from halogen and C_{1-4} alkoxy, C_{1-4} alkyl, C_{1-2} haloalkoxy, hydroxy, cyano, carboxyl, methoxycarbonyl, ethoxycarbonyl, methylsulfonyl and ethylsulfonyl);

each R^4 is, independently, hydrogen, halogen, C_{1-4} alkyl, C_{1-4} haloalkyl, C_{1-4} alkoxy or C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})alkyl; and

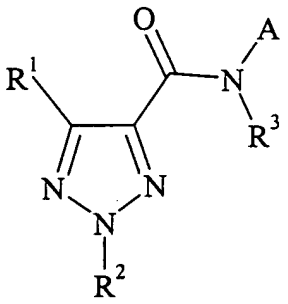
R^5 is hydrogen or optionally substituted C_{1-6} alkyl, optionally substituted C_{1-4} alkoxy, optionally substituted C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})alkyl, optionally substituted C_{1-4} alkylthio(C_{1-4})alkyl or optionally substituted aryl (where the optionally substituted moieties may each have up to 3 substituents, each independently selected from halogen, C_{1-6} alkoxy, C_{1-6} haloalkoxy, cyano, hydroxy, methoxycarbonyl and ethoxycarbonyl).

柒、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第（　　）圖。

(二)本代表圖之元件代表符號簡單說明：

捌、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



(I)

公告本

發明專利說明書

98年11月6日修(更)正替換頁

中文說明書替換頁(98年11月)

（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：92123176

※ 申請日期：92.8.22.　※IPC 分類：C07D249/04, A01N43/647

壹、發明名稱：（中文/英文）

1,2,3-三唑衍生物，製備彼之中間物，及包含/使用其控制或避免植物受植物病蟲害微生物侵害之組合物及方法

1,2,3-TRIAZOLE DERIVATIVES, INTERMEDIATES FOR PREPARING THE SAME, AND COMPOSITION AND METHOD FOR CONTROLLING OR PREVENTING INFESTATION OF PLANTS BY PHYTOPATHOGENIC MICROORGANISMS COMPRISING/USING THE SAME

貳、申 請 人：（共 1 人）

姓名或名稱：（中文/英文）

瑞士商諾華國際作物公司

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

代表人：（中文/英文）

瑪格麗特 安 魯德

MARGARET ANN RUDD

住居所或營業所地址：（中文/英文）

瑞士貝斯爾市雪瓦爾達伊路215號

SCHWARZWALDALLEE 215, CH-4058, BASEL, SWITZERLAND

國　籍：（中文/英文）

瑞士　SWITZERLAND

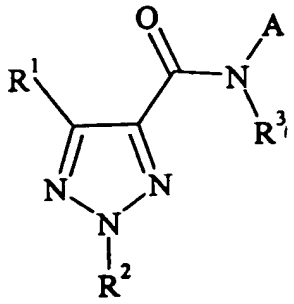
第 092123176 號專利申請案
中文申請專利範圍替換本(99 年 3 月)

雙

99. 3. 30 公告本

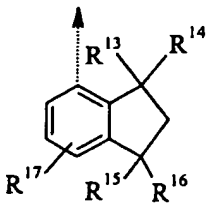
拾、申請專利範圍：

1. 一種式(I)之化合物：

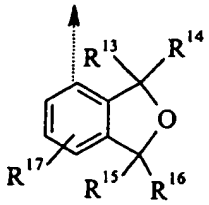


(I)

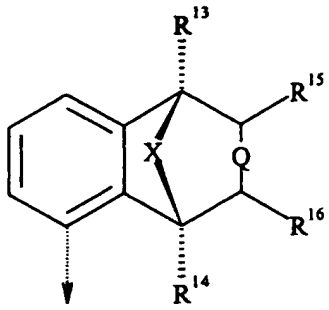
其中A為選自式(A18)、(A19)及(A22)之鄰-取代環；



(A18)



(A19)



(A22)

Q為單鍵或雙鍵；

X為$(CR^{19}R^{20})$；

R^1為CHF_2、CF_3或CH_2F；

R^2為CH_3或C_2H_5；

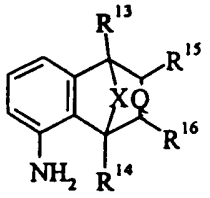
R^3為氫；

R^{13}、R^{14}、R^{15}及R^{16}各獨立為氫或CH_3；

R^{17}為H；

R^{19}及R^{20}各獨立為H、CH_3、C_2H_5、n-C_3H_7、i-C_3H_7、i-C_4H_9、$CH(C_2H_5)_2$、CH_2-環丙基或環戊基；或R^{19}及R^{20}與其所附接之碳原子一起形成3-員碳環。

2. 一種式(IIIa)之化合物



(IIIa)

其中

Q為單鍵或雙鍵；

X為$(CR^{19}R^{20})$；

R^{13}、R^{14}、R^{15}及R^{16}各獨立為氫或CH_3；

R^{19}及R^{20}各獨立為H、CH_3、C_2H_5、n-C_3H_7、i-C_3H_7、i-C_4H_9、$CH(C_2H_5)_2$、CH_2-環丙基或環戊基；或R^{19}及R^{20}與其所附接之碳原子一起形成3-員碳環；

其條件為當R^{13}、R^{14}、R^{15}及R^{16}各為H，則在Q為雙鍵時X不為CH_2。

3. 一種控制微生物且避免植物遭受其侵襲及損害之組合物，其中之活性成分為如申請專利範圍第1項所定義之式(I)化合物，且伴隨一適當載劑。

4. 一種控制或避免培養之植物受植物病蟲害微生物侵害之方法，其係施用如申請專利範圍第1項所定義之式(I)化合物至該植物、其部份或其位置。