

(由本局填寫)

承辦人代碼：
大 類：
I P C 分類：

A6

B6

本案已向：

國(地區) 申請專利，申請日期： 案號： ，☐有 ☐無主張優先權美國 1999年01月27日 09/238,196 ☒有 ☐無主張優先權

有關微生物已寄存於： ，寄存日期： ，寄存號碼：

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

訂

線

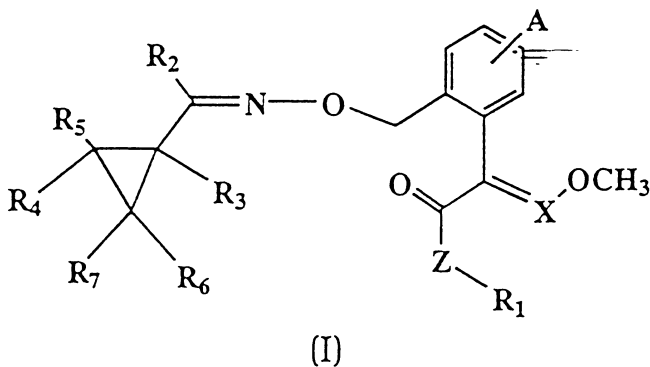
經濟部智慧財產局員工消費合作社印製

五、發明說明 (1)

本發明係關於特定的芳基環丙基肟醚結構，包括該化合物的組合物及使用具黴菌毒性或殺昆蟲劑量之該化合物來控制黴菌及昆蟲的方法。

已知美國專利第5,194,662號及第5,292,759號中已申請包括特定肟醚結構的化合物。我們已經發現具有經取代芳基及雜環基團的新穎環丙基肟醚。這些新穎的衍生物具有廣泛的殺黴菌及殺昆蟲性質。

本發明之新穎環丙基肟醚，其式如下(I)



其中X是N或是CH；Z是O，S或是NR₈；

A係選自下述基團，包括氫，鹵基，氰基，(C₁-C₁₂)烷基，及(C₁-C₁₂)烷氧基；

R₁及R₈係分別選自下述基團，包括氫及(C₁-C₄)烷基；

R₂係選自下述基團，包括氫，(C₁-C₁₂)烷基，鹵基(C₁-C₁₂)烷基，(C₃-C₇)環烷基，鹵基(C₃-C₇)環烷基，(C₂-C₈)烯基，鹵基(C₂-C₈)烯基，(C₂-C₈)炔基，鹵基(C₂-C₈)炔基，芳基，芳烷基，雜環，雜環(C₁-C₄)烷基及C(R₁₀)=N-OR₉；

R₃係選自下述基團，包括氫，(C₁-C₁₂)烷基，鹵基(C₁-C₁₂)烷基，(C₃-C₇)環烷基，鹵基(C₃-C₇)環烷基，(C₂-C₈)烯

五、發明說明 (2)

基，鹵基(C₂-C₈)烯基，(C₂-C₈)炔基，鹵基(C₂-C₈)炔基，芳基，芳烷基，芳基(C₃-C₇)環烷基，雜環及雜環(C₁-C₄)烷基；

R₄及R₅係分別選自下述基團，包括氫，(C₁-C₁₂)烷基，鹵基(C₁-C₁₂)烷基，(C₃-C₇)環烷基，鹵基(C₃-C₇)環烷基，(C₂-C₈)烯基，鹵基(C₂-C₈)烯基，(C₂-C₈)炔基，鹵基(C₂-C₈)炔基，鹵基，氰基，(C₁-C₄)烷氧基羰基，芳基，芳烷基，芳基(C₃-C₇)環烷基，芳基(C₂-C₈)烯基，雜環或是雜環(C₁-C₄)烷基；

R₆係選自下述基團，包括氫，(C₁-C₁₂)烷基，鹵基(C₁-C₁₂)烷基，(C₃-C₇)環烷基，鹵基(C₃-C₇)環烷基，(C₂-C₈)烯基，鹵基(C₂-C₈)烯基，(C₂-C₈)炔基，鹵基(C₂-C₈)炔基，鹵基，氰基，(C₁-C₄)烷氧基羰基，芳基，芳烷基，芳基(C₃-C₇)環烷基，芳基(C₂-C₈)烯基，雜環及雜環(C₁-C₄)烷基；

R₇係選自下述基團，包括芳基，芳烷基，雜環及雜環(C₁-C₄)烷基；

R₉係選自下述基團，包括氫，(C₁-C₁₂)烷基，鹵基(C₁-C₁₂)烷基，(C₂-C₈)烯基，鹵基(C₂-C₈)烯基，(C₂-C₈)炔基，鹵基(C₂-C₈)炔基，(C₁-C₄)烷基羰基，(C₁-C₄)烷氧基羰基，芳基及芳烷基；

R₁₀係選自下述基團，包括氫，(C₁-C₁₂)烷基，鹵基(C₁-C₁₂)烷基，(C₃-C₇)環烷基，鹵基(C₃-C₇)環烷基，(C₂-C₈)烯基，鹵基(C₂-C₈)烯基，(C₂-C₈)炔基，鹵基(C₂-C₈)炔基，芳基，芳烷基，雜環及雜環(C₁-C₄)烷基。

五、發明說明 (3)

上述的(C₁-C₁₂)烷基，(C₂-C₈)烯基，(C₂-C₈)炔基及(C₃-C₇)環烷基可選擇性地經達3取代基所取代，其中包括硝基，鹵甲基，(C₁-C₄)烷氧基羰基，及氰基。

名詞烷基包括含1至12個碳原子的支鏈及直鏈烷基。典型的烷基包括甲基，乙基，正-丙基，異丙基，正-丁基，第二-丁基，異丁基，第三-丁基，正-戊基，異戊基，正-己基，正-庚基，異辛基，壬基，癸基，十一烷基，十二烷基及其相似者。名詞鹵烷基代表經1至3個鹵素取代的烷基。

名詞烯基代表乙烯基化的未飽和烴，直鏈或是支鏈，具有2至8個碳原子的鏈長以及1或2個乙烯鍵。名詞鹵烯基代表經1至3個鹵素原子取代的烯基。名詞炔基代表不飽和烴，直鏈或是支鏈，具有2至12個碳原子的鏈長以及1或2個乙醯鍵。

名詞芳基包括苯基或是萘基，其可經達3個取代基所取代，分別選自下述基團，包括鹵素，氰基，三鹵甲基，苯基，苯氧基，(C₁-C₄)烷基，(C₁-C₄)烷氧基，(C₁-C₄)烷基硫基，(C₁-C₄)烷基亞砷，鹵(C₁-C₄)烷基及鹵(C₁-C₄)烷氧基。

一般的芳基取代基包括，但不限於2-氯苯基，3-氯苯基，4-氯苯基，2-氟苯基，3-氟苯基，4-氟苯基，4-溴苯基，2-甲基苯基，3-甲基苯基，4-甲基苯基，2,4-二溴苯基，3,5-二氟苯基，2,4,6-三氯苯基，2-氯萘基，3-(三氟甲基)苯基，4-(三氟甲基)苯基及2-碘基-4-甲基苯基。

名詞雜環代表經取代的或是未經取代的6員不飽和環，

五、發明說明（4）

包括一個，兩個或是三個雜原子，較佳的是一個，兩個或是三個分別選自下述的雜原子，包括氧，氮及硫或是代表雙環不飽和環系，其中含達10個原子，包括選自氧，氮及硫的雜原子。名詞雜環也代表5員不飽和環，包括一個，兩個或是三個雜原子，較佳的是一個，兩個或是三個分別選自下述的雜原子，包括氧，氮及硫。雜環的範例包括，但不以此為限，2-，3-或是4-嘧啶基，吡咩基，2-，4-，或是5-吡啶基，噻咩基，吡唑，三唑基，咪唑基，2或3-噻吩基，2或3-呋喃基，吡咯基，噁唑基，異噁唑基，噻唑基，異噻唑基，噁二唑基，噻二唑基，氫醌基及異氫醌基。雜環可選擇性地經達兩個取代基所取代，分別選自(C₁-C₄)烷基，鹵素，氰基，硝基及三鹵甲基。

名詞芳烷基係用以描述基團，其中的烷基鏈含1至10個碳原子，且可為支鏈或是直鏈，尤以直鏈為佳，其以如上述的芳基作為芳烷基的最終部位。一般的芳烷基基團可選擇性的是經取代苯甲基，苯乙基，苯丙基及苯丁基。一般的苯甲基是2-氯苯甲基，3-氯苯甲基，4-氯苯甲基，2-氯苯甲基，3-氯苯甲基，4-氯苯甲基，4-三氯甲基苯甲基，2,4-二氯苯甲基，2,4-二溴苯甲基，2-甲基苯甲基，3-甲基苯甲基，及4-甲基苯甲基。一般苯乙基基團包括2-(2-氯苯基)乙基，2-(3-氯苯基)乙基，2-(4-氯苯基)乙基，2-(2-氯苯基)乙基，2-(3-氯苯基)乙基，2-(4-氯苯基)乙基，2-(2-甲基苯基)乙基，2-(3-甲基苯基)乙基，2-(4-甲基苯基)乙基，2-(4-三氯甲基苯基)乙基，2-(2,4-二氯基苯基)乙

五、發明說明(5)

基，2-(3,5-二甲氧基苯基)乙基。一般苯丙基基團是3-苯基丙基，3-(2-氯苯基)丙基，3-(3-氯苯基)丙基，3-(4-氯苯基)丙基，3-(2,4-二氯苯基)丙基，3-(2-氯苯基)丙基，3-(3-氯苯基)丙基，3-(4-氯苯基)丙基，3-(2-甲基苯基)丙基，3-(3-甲基苯基)丙基，3-(4-甲基苯基)丙基，3-(4-三氯甲基苯基)丙基，3-(2,4-二氯苯基)丙基及3-(3,5-二甲基苯基)丙基。一般的苯丁基包括4-苯基丁基，4-(2-氯苯基)丁基，4-(3-氯苯基)丁基，4-(4-氯苯基)丁基，4-(2-氯苯基)丁基，4-(3-氯苯基)丁基，4-(4-氯苯基)丁基，4-(2-甲基苯基)丁基，4-(3-甲基苯基)丁基，4-(4-甲基苯基)丁基及4-(2,4-二氯苯基)丁基。

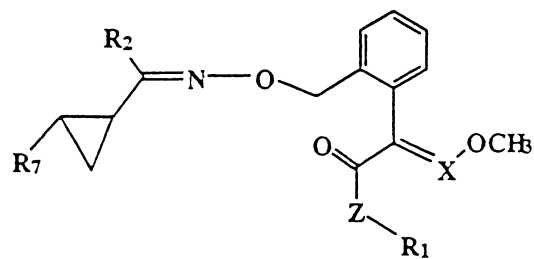
鹵素或鹵基代表碘基，氟基，溴基及氯基基團。

由於其中含有C=C或是C=N雙鍵，通式I之新穎化合物可於製備時獲得E/Z異構混合物。可利用傳統的方法將該異構物分離成個別的組成分。式I的芳基環丙烷可於製備時獲得順式反反式的異構混合物，其可經傳統的方法將其分離成個別的組成分。上述的單一異構化合物及其所生成的混合物均屬本發明範圍，同時可作為殺菌及殺蟲劑用途。

本發明也包括式(I)之鏡像物，鹽及錯化物。

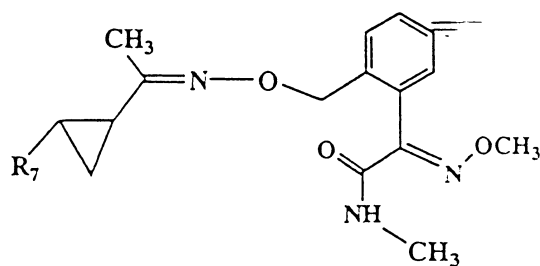
本發明中較佳的是式(I')之化合物，鏡像物，鹽及錯化物，其中A是氫， R_1 及 R_2 是氫或 (C_1-C_4) 烷基， R_3 ， R_4 ， R_5 及 R_6 是氫且 R_7 是芳基，芳烷基，或是雜環。

五、發明說明(6)



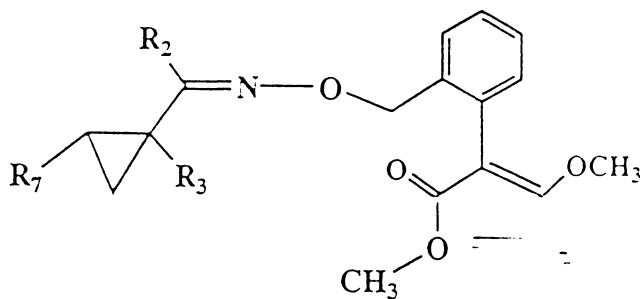
(I')

本發明中較佳的是式(I'')之化合物，鏡像物，鹽及錯化物，其中X是N，Z是NH，R₂是甲基且R₇是芳基。



(I'')

包括在本發明之式I(其中A=R₄=R₅=R₆=H)化合物中的典型化合物如表1之式IV(X=CH且Z是O)所示，其中R₂，R₃及R₇如表1所定義。



式IV

五、發明說明(7)

表 1

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
1.1	H	H	Ph	
1.2	H	H	4-Cl(Ph)	
1.3	H	H	4-Br(Ph)	
1.4	H	H	4-F(Ph)	
1.5	H	H	4-OCH ₃ (Ph)	
1.6	H	H	4-CF ₃ (Ph)	
1.7	H	H	4-NO ₂ (Ph)	
1.8	H	H	2,4-Cl(Ph)	
1.9	H	H	2,4-F(Ph)	
1.10	H	H	3,4-F(Ph)	
1.11	CH ₃	H	Ph—	油狀
1.12	CH ₃	H	2-Cl(Ph)	
1.13	CH ₃	H	3-Cl(Ph)	
1.14	CH ₃	H	4-Cl(Ph)	油狀
1.15	CH ₃	H	2-Br(Ph)	
1.16	CH ₃	H	3-Br(Ph)	
1.17	CH ₃	H	4-Br(Ph)	
1.18	CH ₃	H	2-F(Ph)	
1.19	CH ₃	H	3-F(Ph)	
1.20	CH ₃	H	4-F(Ph)	
1.21	CH ₃	H	2-OCH ₃ (Ph)	
1.22A	CH ₃	H	3-OCH ₃ (Ph)	油狀，異構物A
1.22B	CH ₃	H	3-OCH ₃ (Ph)	油狀，異構物B
1.23	CH ₃	H	4-OCH ₃ (Ph)	
1.24	CH ₃	H	2-CH ₃ (Ph)	
1.25	CH ₃	H	3-CH ₃ (Ph)	
1.26	CH ₃	H	4-CH ₃ (Ph)	
1.27	CH ₃	H	2-CF ₃ (Ph)	油狀，異構物A
1.28	CH ₃	H	3-CF ₃ (Ph)	
1.29	CH ₃	H	4-CF ₃ (Ph)	
1.30	CH ₃	H	2-NO ₂ (Ph)	
1.31	CH ₃	H	3-NO ₂ (Ph)	

五、發明說明 (8)

表 1 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
1.32	CH ₃	H	4-NO ₂ (Ph)	
1.33	CH ₃	H	2,3-Cl(Ph)	
1.34	CH ₃	H	2,4-Cl(Ph)	
1.35	CH ₃	H	2,5-Cl(Ph)	
1.36	CH ₃	H	2,6-Cl(Ph)	
1.37	CH ₃	H	3,4-Cl(Ph)	
1.38	CH ₃	H	3,5-Cl(Ph)	
1.38	CH ₃	H	2,3-F(Ph)	
1.40	CH ₃	H	2,4-F(Ph)	
1.41	CH ₃	H	2,5-F(Ph)	
1.42	CH ₃	H	2,6-F(Ph)	
1.43	CH ₃	H	3,4-F(Ph)	
1.44	CH ₃	H	3,5-F(Ph)	
1.45	C ₂ H ₅	H	Ph	
1.46	C ₂ H ₅	H	2-Cl(Ph)	
1.47	C ₂ H ₅	H	3-Cl(Ph)	
1.48	C ₂ H ₅	H	4-Cl(Ph)	
1.49	C ₂ H ₅	H	4-Br(Ph)	
1.50	C ₂ H ₅	H	4-F(Ph)	
1.51	C ₂ H ₅	H	4-OCH ₃ (Ph)	
1.52	C ₂ H ₅	H	4-CH ₃ (Ph)	
1.53	C ₂ H ₅	H	4-NO ₂ (Ph)	
1.54	C ₂ H ₅	H	2,4-Cl(Ph)	
1.55	C ₂ H ₅	H	2,4-F(Ph)	
1.56	n-C ₃ H ₇	H	Ph	
1.57	n-C ₃ H ₇	H	2-Cl(Ph)	
1.58	n-C ₃ H ₇	H	3-Cl(Ph)	
1.59	n-C ₃ H ₇	H	4-Cl(Ph)	
1.60	n-C ₃ H ₇	H	4-F(Ph)	
1.61A	n-C ₃ H ₇	H	3-OCH ₃ (Ph)	油狀，異構物A
1.61B	n-C ₃ H ₇	H	3-OCH ₃ (Ph)	油狀，異構物B
1.62	n-C ₃ H ₇	H	4-OCH ₃ (Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明(9)

表 1 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
1.63	n-C ₃ H ₇	H	4-CH ₃ (Ph)	
1.64	n-C ₃ H ₇	H	4-NO ₂ (Ph)	
1.65	n-C ₃ H ₇	H	2,4-Cl(Ph)	
1.66	n-C ₃ H ₇	H	2,4-F(Ph)	
1.67	iso-C ₃ H ₇	H	Ph	油狀
1.68	iso-C ₃ H ₇	H	2-Cl(Ph)	
1.69	iso-C ₃ H ₇	H	3-Cl(Ph)	
1.70	iso-C ₃ H ₇	H	4-Cl(Ph)	
1.71	iso-C ₃ H ₇	H	4-Br(Ph)	
1.72	iso-C ₃ H ₇	H	4-F(Ph)	
1.73	iso-C ₃ H ₇	H	4-OCH ₃ (Ph)	
1.74	iso-C ₃ H ₇	H	4-CH ₃ (Ph)	
1.75	iso-C ₃ H ₇	H	4-NO ₂ (Ph)	
1.76	iso-C ₃ H ₇	H	2,4-Cl(Ph)	
1.77	iso-C ₃ H ₇	H	2,4-F(Ph)	
1.78	n-C ₄ H ₉	H	Ph	
1.79	n-C ₄ H ₉	H	2-Cl(Ph)	
1.80	n-C ₄ H ₉	H	3-Cl(Ph)	
1.81	n-C ₄ H ₉	H	4-Cl(Ph)	
1.82	n-C ₄ H ₉	H	4-Br(Ph)	
1.83	n-C ₄ H ₉	H	4-F(Ph)	
1.84	n-C ₄ H ₉	H	4-OCH ₃ (Ph)	
1.85	n-C ₄ H ₉	H	4-CH ₃ (Ph)	
1.86	n-C ₄ H ₉	H	4-NO ₂ (Ph)	
1.87	n-C ₄ H ₉	H	2,4-Cl(Ph)	
1.88	n-C ₄ H ₉	H	2,4-F(Ph)	
1.89	iso-C ₄ H ₉	H	Ph	
1.90	iso-C ₄ H ₉	H	2-Cl(Ph)	
1.91	iso-C ₄ H ₉	H	3-Cl(Ph)	
1.92	iso-C ₄ H ₉	H	4-Cl(Ph)	
1.93	iso-C ₄ H ₉	H	4-F(Ph)	
1.94	iso-C ₄ H ₉	H	3-OCH ₃ (Ph)	油狀

五、發明說明 (10)

表 1 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
1.95	iso-C ₄ H ₉	H	4-OCH ₃ (Ph)	
1.96	iso-C ₄ H ₉	H	4-CH ₃ (Ph)	
1.97	iso-C ₄ H ₉	H	4-NO ₂ (Ph)	
1.98	iso-C ₄ H ₉	H	2,4-Cl(Ph)	
1.99	iso-C ₄ H ₉	H	2,4-F(Ph)	
1.100	c-C ₃ H ₅	H	Ph	
1.101	c-C ₃ H ₅	H	2-Cl(Ph)	
1.102	c-C ₃ H ₅	H	3-Cl(Ph)	油狀
1.103	c-C ₃ H ₅	H	4-Cl(Ph)	
1.104	c-C ₃ H ₅	H	4-F(Ph)	
1.105	c-C ₃ H ₅	H	3-OCH ₃ (Ph)	油狀
1.106	c-C ₃ H ₅	H	4-OCH ₃ (Ph)	
1.107	c-C ₃ H ₅	H	4-CH ₃ (Ph)	
1.108	c-C ₃ H ₅	H	4-NO ₂ (Ph)	
1.109	c-C ₃ H ₅	H	2,4-Cl(Ph)	
1.110	c-C ₃ H ₅	H	2,4-F(Ph)	
1.111	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	Ph	
1.112	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2-Cl(Ph)	
1.113	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	3-Cl(Ph)	
1.114	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-Cl(Ph)	
1.115	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-Br(Ph)	
1.116A	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	3-OCH ₃ (Ph)	油狀，異構物A
1.116	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	3-OCH ₃ (Ph)	油狀
1.117	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-OCH ₃ (Ph)	
1.118	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-CH ₃ (Ph)	
1.119	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-NO ₂ (Ph)	
1.120	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2,4-Cl(Ph)	
1.121	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2,4-F(Ph)	
1.122	C(H)=N-OCH ₃	H	Ph	
1.123	C(H)=N-OCH ₃	H	2-Cl(Ph)	
1.124	C(H)=N-OCH ₃	H	3-Cl(Ph)	
1.125	C(H)=N-OCH ₃	H	4-Cl(Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (11)

表 1 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
1.126	C(H)=N-OCH ₃	H	4-Br(Ph)	
1.127	C(H)=N-OCH ₃	H	4-F(Ph)	
1.128	C(H)=N-OCH ₃	H	4-OCH ₃ (Ph)	
1.129	C(H)=N-OCH ₃	H	4-CH ₃ (Ph)	
1.130	C(H)=N-OCH ₃	H	4-NO ₂ (Ph)	
1.131	C(H)=N-OCH ₃	H	2,4-Cl(Ph)	
1.132	C(H)=N-OCH ₃	H	2,4-F(Ph)	
1.133	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	Ph	油狀，異構物A
1.134	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2-Cl(Ph)	
1.135	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	3-Cl(Ph)	
1.136	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	4-Cl(Ph)	
1.137	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	4-Br(Ph)	
1.138	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	4-F(Ph)	
1.139	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	4-OCH ₃ (Ph)	
1.140	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	4-CH ₃ (Ph)	
1.141	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	4-NO ₂ (Ph)	
1.142	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2,4-Cl(Ph)	
1.143	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2,4-F(Ph)	
1.144	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	Ph	油狀，異構物A
1.145	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2-Cl(Ph)	
1.146	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	3-Cl(Ph)	
1.147	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	4-Cl(Ph)	
1.148	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	4-Br(Ph)	
1.149	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	4-F(Ph)	
1.150	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	4-OCH ₃ (Ph)	
1.151	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	4-CH ₃ (Ph)	
1.152	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	4-NO ₂ (Ph)	
1.153	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2,4-Cl(Ph)	
1.154	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2,4-F(Ph)	
1.155	Ph	H	Ph	油狀
1.156	Ph	H	2-Cl(Ph)	
1.157	Ph	H	3-Cl(Ph)	油狀
1.158	Ph	H	4-Cl(Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (12)

表 1 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
1.159	Ph	H	3-OCH ₃ (Ph)	油狀
1.160	4-Cl(Ph)	H	Ph	油狀
1.161	4-F(Ph)	H	Ph	
1.162	4-F(Ph)	H	4-F(Ph)	
1.163	4-CF ₃ (Ph)	H	Ph	
1.164	4-CF ₃ (Ph)	H	4-CF ₃ (Ph)	
1.165	2,4-Cl(Ph)	H	Ph	
1.166	2,4-Cl(Ph)	H	2,4-Cl(Ph)	
1.167	2,4-F(Ph)	H	Ph	
1.168	CH ₃	CH ₃	Ph	
1.168	C ₂ H ₅	CH ₃	2-Cl(Ph)	
1.170	n-C ₃ H ₇	CH ₃	3-Cl(Ph)	
1.171	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	4-Cl(Ph)	
1.172	n-C ₄ H ₉	CH ₃	4-Br(Ph)	
1.173	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	4-F(Ph)	
1.174	c-C ₃ H ₅	CH ₃	4-OCH ₃ (Ph)	
1.175	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	CH ₃	4-CH ₃ (Ph)	
1.176	C(H)=N-OCH ₃	CH ₃	4-NO ₂ (Ph)	
1.177	C(CH ₃)=N-OCH ₃	CH ₃	2,4-Cl(Ph)	
1.178	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	CH ₃	2,4-F(Ph)	
1.179	Ph	CH ₃	Ph	
1.180	Ph	CH ₃	2-Cl(Ph)	
1.181	Ph	CH ₃	3-Cl(Ph)	
1.182	Ph	CH ₃	4-Cl(Ph)	
1.183	4-Cl(Ph)	CH ₃	Ph	
1.184	4-Cl(Ph)	CH ₃	4-Cl(Ph)	
1.185	4-F(Ph)	CH ₃	Ph	
1.186	4-F(Ph)	CH ₃	4-F(Ph)	
1.187	4-CF ₃ (Ph)	CH ₃	Ph	
1.188	4-CF ₃ (Ph)	CH ₃	4-CF ₃ (Ph) ⁻	
1.189	2,4-Cl(Ph)	CH ₃	Ph	
1.190	2,4-Cl(Ph)	CH ₃	2,4-Cl(Ph)	
1.191	2,4-F(Ph)	CH ₃	Ph	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

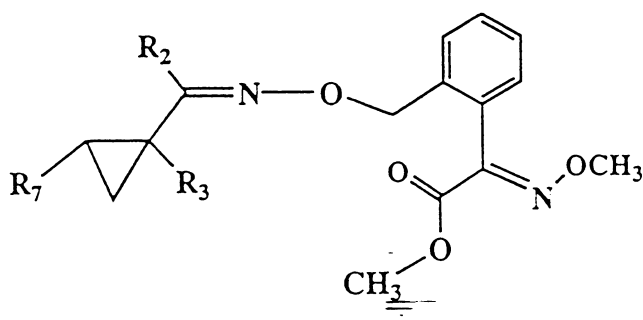
裝

訂

線

五、發明說明 (13)

典型包括本發明之式 I (其中 $A=R_4=R_5=R_7=H$) 化合物包括如表 2 之式 V ($X=N$ 且 Z 是 O) 所示, 其中 R_2 , R_3 及 R_7 如表 2 所定義。



式 V

表 2

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
2.1A	H	H	Ph	油狀, 異構物A
2.1B	H	H	Ph	油狀, 異構物B
2.2	H	H	4-Cl(Ph)	
2.3	H	H	4-Br(Ph)	
2.4	H	H	4-F(Ph)	
2.5	H	H	4-OCH ₃ (Ph)	
2.6	H	H	4-CF ₃ (Ph)	
2.7	H	H	4-NO ₂ (Ph)	
2.8	H	H	2,4-Cl(Ph)	
2.9	H	H	2,4-F(Ph)	
2.10	H	H	3,4-F(Ph)	
2.11	CH ₃	H	Ph	油狀
2.11A	CH ₃	H	Ph	油狀, 異構物A
2.11B	CH ₃	H	Ph	油狀, 異構物B
2.12A	CH ₃	H	2-ClAr	油狀, 異構物A
2.12B	CH ₃	H	2-ClAr	油狀, 異構物B

五、發明說明 (14)

表 2 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
2.13A	CH ₃	H	3-Cl(Ph)	油狀，異構物A
2.13B	CH ₃	H	3-Cl(Ph)	油狀，異構物B
2.14A	CH ₃	H	4-Cl(Ph)	油狀，異構物A
2.14B	CH ₃	H	4-Cl(Ph)	油狀，異構物B
2.15	CH ₃	H	2-Br(Ph)	
2.16	CH ₃	H	3-Br(Ph)	
2.17	CH ₃	H	4-Br(Ph)	
2.18	CH ₃	H	2-F(Ph)	油狀，異構物B
2.19	CH ₃	H	3-F(Ph)	油狀，異構物A
2.20A	CH ₃	H	4-F(Ph)	油狀，異構物A
2.20B	CH ₃	H	4-F(Ph)	油狀，異構物B
2.21A	CH ₃	H	2-OCH ₃ (Ph)	油狀，異構物A
2.21B	CH ₃	H	2-OCH ₃ (Ph)	油狀，異構物B
2.22A	CH ₃	H	3-OCH ₃ (Ph)	油狀，異構物A
2.22B	CH ₃	H	3-OCH ₃ (Ph)	油狀，異構物B
2.23A	CH ₃	H	4-OCH ₃ (Ph)	油狀，異構物A
2.23B	CH ₃	H	4-OCH ₃ (Ph)	油狀，異構物B
2.24	CH ₃	H	2-CH ₃ (Ph)	油狀，異構物A
2.25A	CH ₃	H	3-CH ₃ (Ph)	油狀，異構物A
2.25B	CH ₃	H	3-CH ₃ (Ph)	油狀，異構物B
2.26A	CH ₃	H	4-CH ₃ (Ph)	油狀，異構物A
2.26B	CH ₃	H	4-CH ₃ (Ph)	油狀，異構物B
2.27	CH ₃	H	2-CF ₃ (Ph)	油狀，異構物A
2.28	CH ₃	H	3-CF ₃ (Ph)	油狀，異構物A
2.29	CH ₃	H	4-CF ₃ (Ph)	
2.30	CH ₃	H	2-NO ₂ (Ph)	
2.31	CH ₃	H	3-NO ₂ (Ph)	
2.32	CH ₃	H	4-NO ₂ (Ph)	
2.33	CH ₃	H	2,3-Cl(Ph)	油狀，異構物B
2.34	CH ₃	H	2,4-Cl(Ph)	油狀，異構物A
2.35	CH ₃	H	2,5-Cl(Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (15)

表 2 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
2.36	CH ₃	H	2,6-Cl(Ph)	
2.37A	CH ₃	H	3,4-Cl(Ph)	油狀，異構物A
2.37B	CH ₃	H	3,4-Cl(Ph)	油狀，異構物B
2.38	CH ₃	H	3,5-Cl(Ph)	
2.39	CH ₃	H	2,3-F(Ph)	
2.40	CH ₃	H	2,4-F(Ph)	
2.41	CH ₃	H	2,5-F(Ph)	
2.42	CH ₃	H	2,6-F(Ph)	
2.43	CH ₃	H	3,4-F(Ph)	
2.44	CH ₃	H	3,5-F(Ph)	
2.45	C ₂ H ₅	H	Ph	
2.46	C ₂ H ₅	H	2-Cl(Ph)	
2.47	C ₂ H ₅	H	3-Cl(Ph)	
2.48	C ₂ H ₅	H	4-Cl(Ph)	
2.49	C ₂ H ₅	H	4-Br(Ph)	
2.50	C ₂ H ₅	H	4-F(Ph)	
2.51	C ₂ H ₅	H	4-OCH ₃ (Ph)	
2.52	C ₂ H ₅	H	4-CH ₃ (Ph)	
2.53	C ₂ H ₅	H	4-NO ₂ (Ph)	
2.54	C ₂ H ₅	H	2,4-Cl(Ph)	
2.55	C ₂ H ₅	H	2,4-F(Ph)	
2.56	n-C ₃ H ₇	H	Ph	
2.57	n-C ₃ H ₇	H	2-Cl(Ph)	
2.58	n-C ₃ H ₇	H	3-Cl(Ph)	
2.59	n-C ₃ H ₇	H	4-Cl(Ph)	
2.60	n-C ₃ H ₇	H	4-Br(Ph)	
2.61	n-C ₃ H ₇	H	4-F(Ph)	
2.62	n-C ₃ H ₇	H	4-OCH ₃ (Ph)	
2.63	n-C ₃ H ₇	H	4-CH ₃ (Ph) ⁻	
2.64	n-C ₃ H ₇	H	4-NO ₂ (Ph)	
2.65	n-C ₃ H ₇	H	2,4-Cl(Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (16)

表 2 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
2.66	n-C ₃ H ₇	H	2,4-F(Ph)	
2.67	iso-C ₃ H ₇	H	Ph	油狀，異構物A
2.68	iso-C ₃ H ₇	H	2-Cl(Ph)	
2.69	iso-C ₃ H ₇	H	3-Cl(Ph)	
2.70	iso-C ₃ H ₇	H	4-Cl(Ph)	
2.71	iso-C ₃ H ₇	H	4-Br(Ph)	
2.72	iso-C ₃ H ₇	H	4-F(Ph)	
2.73	iso-C ₃ H ₇	H	4-OCH ₃ (Ph)	
2.74	iso-C ₃ H ₇	H	4-CH ₃ (Ph)	
2.75	iso-C ₃ H ₇	H	4-NO ₂ (Ph)	
2.76	iso-C ₃ H ₇	H	2,4-Cl(Ph)	
2.77	iso-C ₃ H ₇	H	2,4-F(Ph)	
2.78	n-C ₄ H ₉	H	Ph	
2.79	n-C ₄ H ₉	H	2-Cl(Ph)	
2.80	n-C ₄ H ₉	H	3-Cl(Ph)	
2.81	n-C ₄ H ₉	H	4-Cl(Ph)	
2.82	n-C ₄ H ₉	H	4-Br(Ph)	
2.83	n-C ₄ H ₉	H	4-F(Ph)	
2.84	n-C ₄ H ₉	H	4-OCH ₃ (Ph)	
2.85	n-C ₄ H ₉	H	4-CH ₃ (Ph)	
2.86	n-C ₄ H ₉	H	4-NO ₂ (Ph)	
2.87	n-C ₄ H ₉	H	2,4-Cl(Ph)	
2.88	n-C ₄ H ₉	H	2,4-F(Ph)	
2.89	iso-C ₄ H ₉	H	Ph	
2.90	iso-C ₄ H ₉	H	2-Cl(Ph)	
2.91	iso-C ₄ H ₉	H	3-Cl(Ph)	
2.92	iso-C ₄ H ₉	H	4-Cl(Ph)	
2.93	iso-C ₄ H ₉	H	4-Br(Ph)	
2.94	iso-C ₄ H ₉	H	4-F(Ph)	
2.95	iso-C ₄ H ₉	H	4-OCH ₃ (Ph)	
2.96	iso-C ₄ H ₉	H	4-CH ₃ (Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (17)

表 2 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
2.97	iso-C ₄ H ₉	H	4-NO ₂ (Ph)	
2.98	iso-C ₄ H ₉	H	2,4-Cl(Ph)	
2.99	iso-C ₄ H ₉	H	2,4-F(Ph)	
2.100	c-C ₃ H ₅	H	Ph	
2.101	c-C ₃ H ₅	H	2-Cl(Ph)	
2.102	c-C ₃ H ₅	H	3-Cl(Ph)	
2.103	c-C ₃ H ₅	H	4-Cl(Ph)	
2.104	c-C ₃ H ₅	H	4-Br(Ph)	
2.105	c-C ₃ H ₅	H	4-F(Ph)	
2.106	c-C ₃ H ₅	H	4-OCH ₃ (Ph)	
2.107	c-C ₃ H ₅	H	4-CH ₃ (Ph)	
2.108	c-C ₃ H ₅	H	4-NO ₂ (Ph)	
2.109	c-C ₃ H ₅	H	2,4-Cl(Ph)	
2.110	c-C ₃ H ₅	H	2,4-F(Ph)	
2.111	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	Ph	
2.112	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2-Cl(Ph)	
2.113	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	3-Cl(Ph)	
2.114	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-Cl(Ph)	
2.115	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-Br(Ph)	
2.116	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-F(Ph)	
2.117	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-OCH ₃ (Ph)	
2.118	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-CH ₃ (Ph)	
2.119	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-NO ₂ (Ph)	
2.120	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2,4-Cl(Ph)	
2.121	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2,4-F(Ph)	
2.122	C(H)=N-OCH ₃	H	Ph	
2.123	C(H)=N-OCH ₃	H	2-Cl(Ph)	
2.124	C(H)=N-OCH ₃	H	3-Cl(Ph)	
2.125	C(H)=N-OCH ₃	H	4-Cl(Ph)	
2.126	C(H)=N-OCH ₃	H	4-Br(Ph)	
2.127	C(H)=N-OCH ₃	H	4-F(Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (18)

表 2 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
2.128	C(H)=N-OCH ₃	H	4-OCH ₃ (Ph)	
2.129	C(H)=N-OCH ₃	H	4-CH ₃ (Ph)	
2.130	C(H)=N-OCH ₃	H	4-NO ₂ (Ph)	
2.131	C(H)=N-OCH ₃	H	2,4-Cl(Ph)	
2.132	C(H)=N-OCH ₃	H	2,4-F(Ph)	
2.133	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	Ph	
2.134	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2-Cl(Ph)	
2.135	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	3-Cl(Ph)	
2.136	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	4-Cl(Ph)	
2.137	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	4-Br(Ph)	
2.138	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	4-F(Ph)	
2.139	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	4-OCH ₃ (Ph)	
2.140	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	4-CH ₃ (Ph)	
2.141	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	4-NO ₂ (Ph)	
2.142	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2,4-Cl(Ph)	
2.143	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2,4-F(Ph)	
2.144	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	Ph	油狀物，異構物A
2.145	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2-Cl(Ph)	
2.146	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	3-Cl(Ph)	
2.147	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	4-Cl(Ph)	
2.148	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	4-Br(Ph)	
2.149	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	4-F(Ph)	
2.150	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	4-OCH ₃ (Ph)	
2.151	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	4-CH ₃ (Ph)	
2.152	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	4-NO ₂ (Ph)	
2.153	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2,4-Cl(Ph)	
2.154	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2,4-F(Ph)	
2.155	Ph	H	Ph	
2.156	Ph	H	2-Cl(Ph)	
2.157	Ph	H	3-Cl(Ph)	
2.158	Ph	H	4-Cl(Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (19)

表 2 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
2.159	4-Cl(Ph)	H	Ph	
2.160	4-Cl(Ph)	H	4-Cl(Ph)	
2.161	4-F(Ph)	H	Ph	
2.162	4-F(Ph)	H	4-F(Ph)	
2.163	4-CF ₃ (Ph)	H	Ph	
2.164	4-CF ₃ (Ph)	H	4-CF ₃ (Ph)	
2.165	2,4-Cl(Ph)	H	Ph	
2.166	2,4-Cl(Ph)	H	2,4-Cl(Ph)	
2.167	2,4-F(Ph)	H	Ph	
2.168	CH ₃	CH ₃	Ph	
2.169	C ₂ H ₅	CH ₃	2-Cl(Ph)	
2.170	n-C ₃ H ₇	CH ₃	3-Cl(Ph)	
2.171	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	4-Cl(Ph)	
2.172	n-C ₄ H ₉	CH ₃	4-Br(Ph)	
2.173	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	4-F(Ph)	
2.174	c-C ₃ H ₅	CH ₃	4-OCH ₃ (Ph)	
2.175	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	CH ₃	4-CH ₃ (Ph)	
2.176	C(H)=N-OCH ₃	CH ₃	4-NO ₂ (Ph)	
2.177	C(CH ₃)=N-OCH ₃	CH ₃	2,4-Cl(Ph)	
2.178	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	CH ₃	2,4-F(Ph)	
2.179	Ph	CH ₃	Ph	
2.180	Ph	CH ₃	2-Cl(Ph)	
2.181	Ph	CH ₃	3-Cl(Ph)	
2.182	Ph	CH ₃	4-Cl(Ph)	
2.183	4-Cl(Ph)	CH ₃	Ph	
2.184	4-Cl(Ph)	CH ₃	4-Cl(Ph)	
2.185	4-F(Ph)	CH ₃	Ph	
2.186	4-F(Ph)	CH ₃	4-F(Ph)	
2.187	4-CF ₃ (Ph)	CH ₃	Ph	
2.188	4-CF ₃ (Ph)	CH ₃	4-CF ₃ (Ph)	
2.189	2,4-Cl(Ph)	CH ₃	Ph	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (20)

表 2 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
2.190	2,4-Cl(Ph)	CH ₃	2,4-Cl(Ph)	
2.191	2,4-F(Ph)	CH ₃	Ph	
2.192	CH ₃	H	1-萘基	
2.193	C ₂ H ₅	H	1-萘基	
2.194	n-C ₃ H ₇	H	1-萘基	
2.195	iso-C ₃ H ₇	H	1-萘基	
2.196	n-C ₄ H ₉	H	1-萘基	
2.197	iso-C ₄ H ₉	H	1-萘基	
2.198	c-C ₃ H ₅	H	1-萘基	
2.199	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	1-萘基	
2.200	C(H)=N-OCH ₃	H	1-萘基	
2.201	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	1-萘基	
2.202	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	1-萘基	
2.203	Ph	H	1-萘基	
2.204	2-Cl(Ph)	H	1-萘基	
2.205	3-Cl(Ph)	H	1-萘基	
2.206	4-Cl(Ph)	H	1-萘基	
2.207	2-F(Ph)	H	1-萘基	
2.208	3-F(Ph)	H	1-萘基	
2.209	4-F(Ph)	H	1-萘基	
2.210	2-CF ₃ (Ph)	H	1-萘基	
2.211	3-CF ₃ (Ph)	H	1-萘基	
2.212	4-CF ₃ (Ph)	H	1-萘基	
2.213	2,4-Cl(Ph)	H	1-萘基	
2.214	2,4-Cl(Ph)	H	1-萘基	
2.215	2,4-F(Ph)	H	1-萘基	
2.216	CH ₃	CH ₃	1-萘基	
2.217	C ₂ H ₅	CH ₃	1-萘基	
2.218	n-C ₃ H ₇	CH ₃	1-萘基	
2.219	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	1-萘基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

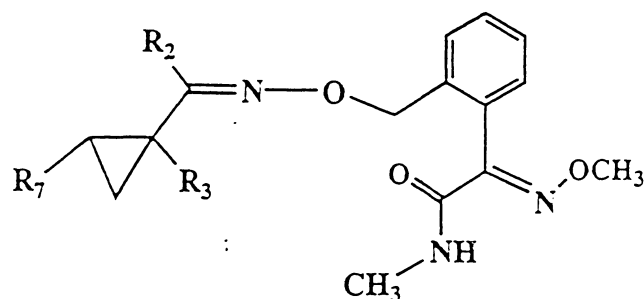
五、發明說明 (21)

表 2 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
2.220	n-C ₄ H ₉	CH ₃	1-萘基	
2.221	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	1-萘基	
2.222	c-C ₃ H ₅	CH ₃	1-萘基	
2.223	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	CH ₃	1-萘基	
2.224	C(H)=N-OCH ₃	CH ₃	1-萘基	
2.225	C(CH ₃)=N-OCH ₃	CH ₃	1-萘基	
2.226	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	CH ₃	1-萘基	
2.227	Ph	CH ₃	1-萘基	
2.228	2-Cl(Ph)	CH ₃	1-萘基	
2.229	3-Cl(Ph)	CH ₃	1-萘基	
2.230	4-Cl(Ph)	CH ₃	1-萘基	
2.231	2-F(Ph)	CH ₃	1-萘基	
2.232	3-F(Ph)	CH ₃	1-萘基	
2.233	4-F(Ph)	CH ₃	1-萘基	
2.234	2-CF ₃ (Ph)	CH ₃	1-萘基	
2.235	3-CF ₃ (Ph)	CH ₃	1-萘基	
2.236	4-CF ₃ (Ph)	CH ₃	1-萘基	
2.237	2,4-Cl(Ph)	CH ₃	1-萘基	
2.238	2,4-Cl(Ph)	CH ₃	1-萘基	
2.239	2,4-F(Ph)	CH ₃	1-萘基	

典型包括本發明之式 I (其中 $A=R_4=R_5=R_6=H$) 化合物包括如表 3 之式 VII ($X=N$ 且 Z 是 NH) 所示，其中 R_2 、 R_3 及 R_7 如表 3 所定義。

五、發明說明 (22)



式 VII

表 3

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
3.1A	H	H	Ph	油狀物，異構物A
3.1B	H	H	Ph	油狀物，異構物B
3.2	H	H	4-Cl(Ph)	
3.3	H	H	4-Br(Ph)	
3.4	H	H	4-F(Ph)	
3.5	H	H	4-OCH ₃ (Ph)	
3.6	H	H	4-CH ₃ (Ph)	
3.7	H	H	4-NO ₂ (Ph)	
3.8	H	H	2,4-Cl(Ph)	
3.8	H	H	2,4-F(Ph)	
3.10	H	H	3,4-F(Ph)	
3.11	CH ₃	H	Ph	油狀物
3.11A	CH ₃	H	Ph	油狀物，異構物A
3.11B	CH ₃	H	Ph	油狀物，異構物B
3.12A	CH ₃	H	2-Cl(Ph)	油狀物，異構物A
3.12B	CH ₃	H	2-Cl(Ph)	油狀物，異構物B
3.13A	CH ₃	H	3-Cl(Ph)	油狀物，異構物A
3.13B	CH ₃	H	3-Cl(Ph)	油狀物，異構物B
3.14B	CH ₃	H	4-Cl(Ph)	油狀物，異構物B
3.14A	CH ₃	H	4-Cl(Ph)	油狀物，異構物A
3.15	CH ₃	H	2-Br(Ph)	
3.16	CH ₃	H	3-Br(Ph)	

五、發明說明 (23)

表 3 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
3.17	CH ₃	H	4-Br(Ph)	
3.18	CH ₃	H	2-F(Ph)	
3.19	CH ₃	H	3-F(Ph)	油狀物
3.20A	CH ₃	H	4-F(Ph)	油狀物，異構物A
3.20B	CH ₃	H	4-F(Ph)	油狀物，異構物B
3.21A	CH ₃	H	2-OCH ₃ (Ph)	油狀物，異構物A
3.21B	CH ₃	H	2-OCH ₃ (Ph)	油狀物，異構物B
3.22A	CH ₃	H	3-OCH ₃ (Ph)	油狀物，異構物A
3.22B	CH ₃	H	3-OCH ₃ (Ph)	油狀物，異構物B
3.23A	CH ₃	H	4-OCH ₃ (Ph)	油狀物，異構物A
3.23B	CH ₃	H	4-OCH ₃ (Ph)	油狀物，異構物B
3.24A	CH ₃	H	2-CH ₃ (Ph)	油狀物，異構物A
3.24B	CH ₃	H	2-CH ₃ (Ph)	油狀物，異構物B
3.25A	CH ₃	H	3-CH ₃ (Ph)	油狀物，異構物A
3.25B	CH ₃	H	3-CH ₃ (Ph)	油狀物，異構物B
3.26A	CH ₃	H	4-CH ₃ (Ph)	油狀物，異構物A
3.26B	CH ₃	H	4-CH ₃ (Ph)	油狀物，異構物B
3.27	CH ₃	H	2-CF ₃ (Ph)	油狀物
3.28A	CH ₃	H	3-CF ₃ (Ph)	油狀物，異構物A
3.28B	CH ₃	H	3-CF ₃ (Ph)	油狀物，異構物B
3.29	CH ₃	H	4-CF ₃ (Ph)	
3.30	CH ₃	H	2-NO ₂ (Ph)	
3.31	CH ₃	H	3-NO ₂ (Ph)	
3.32	CH ₃	H	4-NO ₂ (Ph)	
3.33B	CH ₃	H	2,3-Cl(Ph)	油狀物，異構物B
3.33A	CH ₃	H	2,3-Cl(Ph)	油狀物，異構物A
3.34A	CH ₃	H	2,4-Cl(Ph)	油狀物，異構物A
3.34B	CH ₃	H	2,4-Cl(Ph)	油狀物，異構物B
3.35	CH ₃	H	2,5-Cl(Ph)	
3.36	CH ₃	H	2,6-Cl(Ph)	
3.37	CH ₃	H	3,4-Cl(Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (24)

表 3 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
3.37A	CH ₃	H	3,4-Cl(Ph)	油狀物，異構物A
3.37B	CH ₃	H	3,4-Cl(Ph)	油狀物，異構物B
3.38	CH ₃	H	3,5-Cl(Ph)	
3.39	CH ₃	H	2,3-F(Ph)	
3.40	CH ₃	H	2,4-F(Ph)	
3.41	CH ₃	H	2,5-F(Ph)	
3.42	CH ₃	H	2,6-F(Ph)	
3.43	CH ₃	H	3,4-F(Ph)	
3.44	CH ₃	H	3,5-F(Ph)	
3.45	C ₂ H ₅	H	Ph	
3.46	C ₂ H ₅	H	2-Cl(Ph)	
3.47	C ₂ H ₅	H	3-Cl(Ph)	
3.48	C ₂ H ₅	H	4-Cl(Ph)	
3.49	C ₂ H ₅	H	4-Br(Ph)	
3.50	C ₂ H ₅	H	4-F(Ph)	
3.51	C ₂ H ₅	H	4-OCH ₃ (Ph)	
3.52	C ₂ H ₅	H	4-CH ₃ (Ph)	
3.53	C ₂ H ₅	H	4-NO ₂ (Ph)	
3.54	C ₂ H ₅	H	2,4-Cl(Ph)	
3.55	C ₂ H ₅	H	2,4-F(Ph)	
3.56	n-C ₃ H ₇	H	Ph	
3.57	n-C ₃ H ₇	H	2-Cl(Ph)	
3.58	n-C ₃ H ₇	H	3-Cl(Ph)	
3.59	n-C ₃ H ₇	H	4-Cl(Ph)	
3.60	n-C ₃ H ₇	H	4-Br(Ph)	
3.61	n-C ₃ H ₇	H	4-F(Ph)	
3.62	n-C ₃ H ₇	H	4-OCH ₃ (Ph)	
3.63	n-C ₃ H ₇	H	4-CH ₃ (Ph)	
3.64	n-C ₃ H ₇	H	4-NO ₂ (Ph)	
3.65	n-C ₃ H ₇	H	2,4-Cl(Ph)	
3.66	n-C ₃ H ₇	H	2,4-F(Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (25)

表 3 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
3.67	iso-C ₃ H ₇	H	Ph	油狀物，異構物A
3.68	iso-C ₃ H ₇	H	2-Cl(Ph)	
3.69	iso-C ₃ H ₇	H	3-Cl(Ph)	
3.70	iso-C ₃ H ₇	H	4-Cl(Ph)	
3.71	iso-C ₃ H ₇	H	4-Br(Ph)	
3.72	iso-C ₃ H ₇	H	4-F(Ph)	
3.73	iso-C ₃ H ₇	H	4-OCH ₃ (Ph)	
3.74	iso-C ₃ H ₇	H	4-CH ₃ (Ph)	
3.75	iso-C ₃ H ₇	H	4-NO ₂ (Ph)	
3.76	iso-C ₃ H ₇	H	2,4-Cl(Ph)	
3.77	iso-C ₃ H ₇	H	2,4-F(Ph)	
3.78	n-C ₄ H ₉	H	Ph	
3.79	n-C ₄ H ₉	H	2-Cl(Ph)	
3.80	n-C ₄ H ₉	H	3-Cl(Ph)	
3.81	n-C ₄ H ₉	H	4-Cl(Ph)	
3.82	n-C ₄ H ₉	H	4-Br(Ph)	
3.83	n-C ₄ H ₉	H	4-F(Ph)	
3.84	n-C ₄ H ₉	H	4-OCH ₃ (Ph)	
3.85	n-C ₄ H ₉	H	4-CH ₃ (Ph)	
3.86	n-C ₄ H ₉	H	4-NO ₂ (Ph)	
3.87	n-C ₄ H ₉	H	2,4-Cl(Ph)	
3.88	n-C ₄ H ₉	H	2,4-F(Ph)	
3.89	iso-C ₄ H ₉	H	Ph	
3.90	iso-C ₄ H ₉	H	2-Cl(Ph)	
3.91	iso-C ₄ H ₉	H	3-Cl(Ph)	
3.92	iso-C ₄ H ₉	H	4-Cl(Ph)	
3.93	iso-C ₄ H ₉	H	4-Br(Ph)	
3.94	iso-C ₄ H ₉	H	4-F(Ph)	
3.95	iso-C ₄ H ₉	H	4-OCH ₃ (Ph)	
3.96	iso-C ₄ H ₉	H	4-CH ₃ (Ph)	
3.97	iso-C ₄ H ₉	H	4-NO ₂ (Ph)	
3.98	iso-C ₄ H ₉	H	2,4-Cl(Ph)	

五、發明說明 (26)

表 3 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
3.99	iso-C ₄ H ₉	H	2,4-F(Ph)	
3.100	c-C ₃ H ₅	H	Ph	
3.101	c-C ₃ H ₅	H	2-Cl(Ph)	
3.102	c-C ₃ H ₅	H	3-Cl(Ph)	
3.103	c-C ₃ H ₅	H	4-Cl(Ph)	
3.104	c-C ₃ H ₅	H	4-Br(Ph)	
3.105	c-C ₃ H ₅	H	4-F(Ph)	
3.106	c-C ₃ H ₅	H	4-OCH ₃ (Ph)	
3.107	c-C ₃ H ₅	H	4-CH ₃ (Ph)	
3.108	c-C ₃ H ₅	H	4-NO ₂ (Ph)	
3.109	c-C ₃ H ₅	H	2,4-Cl(Ph)	
3.110	c-C ₃ H ₅	H	2,4-F(Ph)	
3.111	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	Ph	
3.112	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2-Cl(Ph)	
3.113	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	3-Cl(Ph)	
3.114	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-Cl(Ph)	
3.115	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-Br(Ph)	
3.116	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-F(Ph)	
3.117	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-OCH ₃ (Ph)	
3.118	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-CH ₃ (Ph)	
3.119	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-NO ₂ (Ph)	
3.120	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2,4-Cl(Ph)	
3.121	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2,4-F(Ph)	
3.122	C(H)=N-OCH ₃	H	Ph	
3.123	C(H)=N-OCH ₃	H	2-Cl(Ph)	
3.124	C(H)=N-OCH ₃	H	3-Cl(Ph)	
3.125	C(H)=N-OCH ₃	H	4-Cl(Ph)	
3.126	C(H)=N-OCH ₃	H	4-Br(Ph)	
3.127	C(H)=N-OCH ₃	H	4-F(Ph)	
3.128	C(H)=N-OCH ₃	H	4-OCH ₃ (Ph)	
3.129	C(H)=N-OCH ₃	H	4-CH ₃ (Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

總

五、發明說明 (27)

表 3 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
3.130	$C(H)=N-OCH_3$	H	4- NO_2 (Ph)	
3.131	$C(H)=N-OCH_3$	H	2,4-Cl(Ph)	
3.132	$C(H)=N-OCH_3$	H	2,4-F(Ph)	
3.133	$C(CH_3)=N-OCH_3$	H	Ph	
3.134	$C(CH_3)=N-OCH_3$	H	2-Cl(Ph)	
3.135	$C(CH_3)=N-OCH_3$	H	3-Cl(Ph)	
3.136	$C(CH_3)=N-OCH_3$	H	4-Cl(Ph)	
3.137	$C(CH_3)=N-OCH_3$	H	4-Br(Ph)	
3.138	$C(CH_3)=N-OCH_3$	H	4-F(Ph)	
3.139	$C(CH_3)=N-OCH_3$	H	4- OCH_3 (Ph)	
3.140	$C(CH_3)=N-OCH_3$	H	4- $\underline{CH}_3$ (Ph)	
3.141	$C(CH_3)=N-OCH_3$	H	4- NO_2 (Ph)	
3.142	$C(CH_3)=N-OCH_3$	H	2,4-Cl(Ph)	
3.143	$C(CH_3)=N-OCH_3$	H	2,4-F(Ph)	
3.144	$C(C_2H_5)=N-OCH_3$	H	Ph	油狀物
3.145	$C(C_2H_5)=N-OCH_3$	H	2-Cl(Ph)	
3.146	$C(C_2H_5)=N-OCH_3$	H	3-Cl(Ph)	
3.147	$C(C_2H_5)=N-OCH_3$	H	4-Cl(Ph)	
3.148	$C(C_2H_5)=N-OCH_3$	H	4-Br(Ph)	
3.149	$C(C_2H_5)=N-OCH_3$	H	4-F(Ph)	
3.150	$C(C_2H_5)=N-OCH_3$	H	4- OCH_3 (Ph)	
3.151	$C(C_2H_5)=N-OCH_3$	H	4- $\underline{CH}_3$ (Ph)	
3.152	$C(C_2H_5)=N-OCH_3$	H	4- NO_2 (Ph)	
3.153	$C(C_2H_5)=N-OCH_3$	H	2,4-Cl(Ph)	
3.154	$C(C_2H_5)=N-OCH_3$	H	2,4-F(Ph)	
3.155	Ph	H	Ph	
3.156	Ph	H	2-Cl(Ph)	
3.157	Ph	H	3- $\underline{Cl}$ (Ph)	
3.158	Ph	H	4-Cl(Ph)	
3.159	4-Cl(Ph)	H	Ph	
3.160	4-Cl(Ph)	H	4-Cl(Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (28)

表 3 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
3.161	4-F(Ph)	H	Ph	
3.162	4-F(Ph)	H	4-F(Ph)	
3.163	4-CF ₃ (Ph)	H	Ph	
3.164	4-CF ₃ (Ph)	H	4-CF ₃ (Ph)	
3.165	2,4-Cl(Ph)	H	Ph	
3.166	2,4-Cl(Ph)	H	2,4-Cl(Ph)	
3.167	2,4-F(Ph)	H	Ph	
3.168	CH ₃	H	Ph	
3.169	C ₂ H ₅	H	2-Cl(Ph)	
3.170	n-C ₃ H ₇	H	3-Cl(Ph)	
3.171	iso-C ₃ H ₇	H	4-Cl(Ph)	
3.172	n-C ₄ H ₉	H	4-Br(Ph)	
3.173	iso-C ₄ H ₉	H	4-F(Ph)	
3.174	c-C ₃ H ₅	H	4-OCH ₃ (Ph)	
3.175	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-CH ₃ (Ph)	
3.176	C(H)=N-OCH ₃	H	4-NO ₂ (Ph)	
3.177	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2,4-Cl(Ph)	
3.178	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2,4-F(Ph)	
3.179	Ph	H	Ph	
3.180	Ph	H	2-Cl(Ph)	
3.181	Ph	H	3-Cl(Ph)	
3.182	Ph	H	4-Cl(Ph)	
3.183	4-Cl(Ph)	H	Ph	
3.184	4-Cl(Ph)	H	4-Cl(Ph)	
3.185	4-F(Ph)	H	Ph	
3.186	4-F(Ph)	H	4-F(Ph)	
3.187	4-CF ₃ (Ph)	H	Ph	
3.188	4-CF ₃ (Ph)	H	4-CF ₃ (Ph)	
3.189	2,4-Cl(Ph)	H	Ph	
3.190	2,4-Cl(Ph)	H	2,4-Cl(Ph)	
3.191	2,4-F(Ph)	H	Ph	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (29)

表 3 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
3.192	CH ₃	H	1-萘基	
3.193	C ₂ H ₅	H	1-萘基	
3.194	n-C ₃ H ₇	H	1-萘基	
3.195	iso-C ₃ H ₇	H	1-萘基	
3.196	n-C ₄ H ₉	H	1-萘基	
3.197	iso-C ₄ H ₉	H	1-萘基	
3.198	c-C ₃ H ₅	H	1-萘基	
3.199	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	1-萘基	
3.200	C(H)=N-OCH ₃	H	1-萘基	
3.201	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	1-萘基	
3.202	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	1-萘基	
3.203	Ph	H	1-萘基	
3.204	2-Cl(Ph)	H	1-萘基	
3.205	3-Cl(Ph)	H	1-萘基	
3.206	4-Cl(Ph)	H	1-萘基	
3.207	2-F(Ph)	H	1-萘基	
3.208	3-F(Ph)	H	1-萘基	
3.209	4-F(Ph)	H	1-萘基	
3.210	2-CF ₃ (Ph)	H	1-萘基	
3.211	3-CF ₃ (Ph)	H	1-萘基	
3.212	4-CF ₃ (Ph)	H	1-萘基	
3.213	2,4-Cl(Ph)	H	1-萘基	
3.214	2,4-Cl(Ph)	H	1-萘基	
3.215	2,4-F(Ph)	H	1-萘基	
3.216	CH ₃	H	1-萘基	
3.217	C ₂ H ₅	H	1-萘基	
3.218	n-C ₃ H ₇	H	1-萘基	
3.219	iso-C ₃ H ₇	H	1-萘基	
3.220	n-C ₄ H ₉	H	1-萘基	
3.221	iso-C ₄ H ₉	H	1-萘基	
3.222	c-C ₃ H ₅	H	1-萘基	

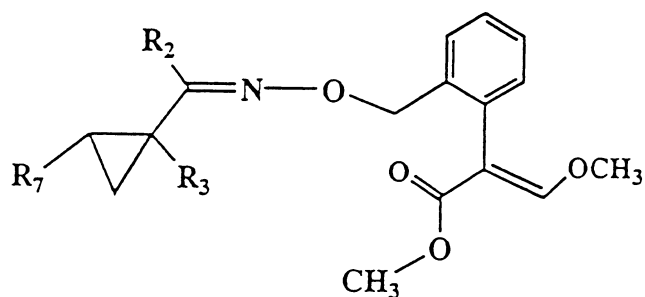
五、發明說明 (30)

表 3 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
3.223	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	1-萘基	
3.224	C(H)=N-OCH ₃	H	1-萘基	
3.225	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	1-萘基	
3.226	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	1-萘基	
3.227	Ph	H	1-萘基	
3.228	2-Cl(Ph)	H	1-萘基	
3.229	3-Cl(Ph)	H	1-萘基	
3.230	4-Cl(Ph)	H	1-萘基	
3.231	2-F(Ph)	H	1-萘基	
3.232	3-F(Ph)	H	1-萘基	
3.233	4-F(Ph)	H	1-萘基	
3.234	2-CF ₃ (Ph)	H	1-萘基	
3.235	3-CF ₃ (Ph)	H	1-萘基	
3.236	4-CF ₃ (Ph)	H	1-萘基	
3.237	2,4-Cl(Ph)	H	1-萘基	
3.238	2,4-Cl(Ph)	H	1-萘基	
3.239	2,4-F(Ph)	H	1-萘基	

典型包括本發明之式 I (其中 $A=R_4=R_5=R_6=H$) 化合物如表 4 之式 IV ($X=CH$ 且 Z 是 O) 所示, 其中 R_2 、 R_3 及 R_7 如表 4 所定義。

五、發明說明 (31)



式 IV

表 4

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
4.1	H	Ph	Ph	
4.2	H	Ph	2-Cl(Ph)	
4.3	H	Ph	3-Cl(Ph)	
4.4	H	Ph	4-Cl(Ph)	
4.5	H	Ph	2-Br(Ph)	
4.6	H	Ph	3-Br(Ph)	
4.7	H	Ph	4-Br(Ph)	
4.8	H	Ph	2-F(Ph)	
4.09	H	Ph	3-F(Ph)	
4.10	H	Ph	4-F(Ph)	
4.11	H	Ph	2-OCH ₃ (Ph)	
4.12	H	Ph	3-OCH ₃ (Ph)	
4.13	H	Ph	4-OCH ₃ (Ph)	
4.14	H	Ph	2-OC ₂ H ₅ (Ph)	
4.15	H	Ph	3-OC ₂ H ₅ (Ph)	
4.16	H	Ph	4-OC ₂ H ₅ (Ph)	
4.17	H	Ph	4-OPh(Ph)	
4.18	H	Ph	2-CH ₃ (Ph)	
4.19	H	Ph	3-CH ₃ (Ph)	
4.20	H	Ph	4-CH ₃ (Ph)	
4.21	H	Ph	2-CF ₃ (Ph)	

五、發明說明 (32)

表 4 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
4.22	H	Ph	3-CF ₃ (Ph)	
4.23	H	Ph	4-CF ₃ (Ph)	
4.24	H	Ph	2-NO ₂ (Ph)	
4.25	H	Ph	3-NO ₂ (Ph)	
4.26	H	Ph	4-NO ₂ (Ph)	
4.27	H	Ph	2,3-Cl(Ph)	
4.28	H	Ph	2,4-Cl(Ph)	
4.29	H	Ph	2,5-Cl(Ph)	
4.30	H	Ph	2,6-Cl(Ph)	
4.31	H	Ph	3,4-Cl(Ph)	
4.32	H	Ph	3,5-Cl(Ph)	
4.33	H	Ph	2,3-F(Ph)	
4.34	H	Ph	2,4-F(Ph)	
4.35	H	Ph	2,5-F(Ph)	
4.36	H	Ph	2,6-F(Ph)	
4.37	H	Ph	3,4-F(Ph)	
4.38	H	Ph	3,5-F(Ph)	
4.39	CH ₃	Ph	Ph	
4.40	CH ₃	Ph	2-Cl(Ph)	
4.41	CH ₃	Ph	3-Cl(Ph)	
4.42	CH ₃	Ph	4-Cl(Ph)	
4.43	CH ₃	Ph	2-Br(Ph)	
4.44	CH ₃	Ph	3-Br(Ph)	
4.45	CH ₃	Ph	4-Br(Ph)	
4.46	CH ₃	Ph	2-F(Ph)	
4.47	CH ₃	Ph	3-F(Ph)	
4.48	CH ₃	Ph	4-F(Ph)	
4.49	CH ₃	Ph	2-OCH ₃ (Ph)	
4.50	CH ₃	Ph	3-OCH ₃ (Ph)	
4.51	CH ₃	Ph	4-OCH ₃ (Ph)	
4.52	CH ₃	Ph	2-OC ₂ H ₅ (Ph)	
4.53	CH ₃	Ph	3-OC ₂ H ₅ (Ph)	

五、發明說明 (33)

表 4 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
4.54	CH ₃	Ph	4-OC ₂ H ₅ (Ph)	
4.55	CH ₃	Ph	4-OPh(Ph)	
4.56	CH ₃	Ph	2-CH ₃ (Ph)	
4.57	CH ₃	Ph	3-CH ₃ (Ph)	
4.58	CH ₃	Ph	4-CH ₃ (Ph)	
4.59	CH ₃	Ph	2-CF ₃ (Ph)	
4.60	CH ₃	Ph	3-CF ₃ (Ph)	
4.61	CH ₃	Ph	4-CF ₃ (Ph)	
4.62	CH ₃	Ph	4-OCF ₃ (Ph)	
4.63	CH ₃	Ph	2-NO ₂ (Ph)	
4.64	CH ₃	Ph	3-NO ₂ (Ph)	
4.65	CH ₃	Ph	4-NO ₂ (Ph)	
4.66	CH ₃	Ph	2,3-Cl(Ph)	
4.67	CH ₃	Ph	2,4-Cl(Ph)	
4.68	CH ₃	Ph	2,5-Cl(Ph)	
4.69	CH ₃	Ph	2,6-Cl(Ph)	
4.70	CH ₃	Ph	3,4-Cl(Ph)	
4.71	CH ₃	Ph	3,5-Cl(Ph)	
4.72	CH ₃	Ph	2,3-F(Ph)	
4.73	CH ₃	Ph	2,4-F(Ph)	
4.74	CH ₃	Ph	2,5-F(Ph)	
4.75	CH ₃	Ph	2,6-F(Ph)	
4.76	CH ₃	Ph	3,4-F(Ph)	
4.77	CH ₃	Ph	3,5-F(Ph)	
4.78	C ₂ H ₅	Ph	2-Cl(Ph)	
4.79	n-C ₃ H ₇	Ph	3-Cl(Ph)	
4.80	iso-C ₃ H ₇	Ph	4-Cl(Ph)	
4.81	n-C ₄ H ₉	Ph	4-Br(Ph)	
4.82	iso-C ₄ H ₉	Ph	4-F(Ph)	
4.83	c-C ₃ H ₅	Ph	4-OCH ₃ (Ph)	
4.84	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	Ph	4-CH ₃ (Ph)	
4.85	C(H)=N-OCH ₃	Ph	4-NO ₂ (Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (34)

表 4 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
4.86	$C(CH_3)=N-OCH_3$	Ph	2,4-Cl(Ph)	
4.87	$C(C_2H_5)=N-OCH_3$	Ph	2,4-F(Ph)	
4.88	Ph	Ph	Ph	
4.89	Ph	Ph	2-Cl(Ph)	
4.90	Ph	Ph	3-Cl(Ph)	
4.91	Ph	Ph	4-Cl(Ph)	
4.92	4-Cl(Ph)	Ph	Ph	
4.93	4-Cl(Ph)	Ph	4-Cl(Ph)	
4.94	4-F(Ph)	Ph	Ph	
4.95	4-F(Ph)	Ph	4-F(Ph)	
4.96	4-CF ₃ (Ph)	Ph	Ph	
4.97	4-CF ₃ (Ph)	Ph	4-CF ₃ (Ph)	
4.98	2,4-Cl(Ph)	Ph	Ph	
4.99	2,4-Cl(Ph)	Ph	2,4-Cl(Ph)	
4.100	2,4-F(Ph)	Ph	Ph	
4.101	H	2-Cl(Ph)	Ph	
4.102	CH ₃	2-Cl(Ph)	Ph	
4.103	C ₂ H ₅	2-Cl(Ph)	2-Cl(Ph)	
4.104	n-C ₃ H ₇	2-Cl(Ph)	3-Cl(Ph)	
4.105	iso-C ₃ H ₇	2-Cl(Ph)	4-Cl(Ph)	
4.106	n-C ₄ H ₉	2-Cl(Ph)	4-Br(Ph)	
4.107	iso-C ₄ H ₉	2-Cl(Ph)	4-F(Ph)	
4.108	c-C ₃ H ₅	2-Cl(Ph)	4-OCH ₃ (Ph)	
4.109	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	2-Cl(Ph)	4-CH ₃ (Ph)	
4.110	$C(H)=N-OCH_3$	2-Cl(Ph)	4-NO ₂ (Ph)	
4.111	$C(CH_3)=N-OCH_3$	2-Cl(Ph)	2,4-Cl(Ph)	
4.112	$C(C_2H_5)=N-OCH_3$	2-Cl(Ph)	2,4-F(Ph)	
4.113	Ph	2-Cl(Ph)	2-Cl(Ph)	
4.114	Ph	2-Cl(Ph)	3-Cl(Ph)	
4.115	Ph	2-Cl(Ph)	4-Cl(Ph)	
4.116	4-Cl(Ph)	2-Cl(Ph)	Ph	
4.117	4-Cl(Ph)	2-Cl(Ph)	4-Cl(Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (35)

表 4 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
4.118	4-F(Ph)	2-Cl(Ph)	Ph	
4.119	4-F(Ph)	2-Cl(Ph)	4-F(Ph)	
4.120	4-CF ₃ (Ph)	2-Cl(Ph)	Ph	
4.121	4-CF ₃ (Ph)	2-Cl(Ph)	4-CF ₃ (Ph)	
4.122	2,4-Cl(Ph)	2-Cl(Ph)	Ph	
4.123	2,4-Cl(Ph)	2-Cl(Ph)	2,4-Cl(Ph)	
4.124	2,4-F(Ph)	2-Cl(Ph)	Ph	
4.125	H	4-Cl(Ph)	Ph	
4.126	CH ₃	4-Cl(Ph)	Ph	
4.127	C ₂ H ₅	4-Cl(Ph)	2-Cl(Ph)	
4.128	n-C ₃ H ₇	4-Cl(Ph)	3-Cl(Ph)	
4.129	iso-C ₃ H ₇	4-Cl(Ph)	4-Cl(Ph)	
4.130	n-C ₄ H ₉	4-Cl(Ph)	4-Br(Ph)	
4.131	iso-C ₄ H ₉	4-Cl(Ph)	4-F(Ph)	
4.132	c-C ₃ H ₅	4-Cl(Ph)	4-OCH ₃ (Ph)	
4.133	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	4-Cl(Ph)	4-CH ₃ (Ph)	
4.134	C(H)=N-OCH ₃	4-Cl(Ph)	4-NO ₂ (Ph)	
4.135	C(CH ₃)=N-OCH ₃	4-Cl(Ph)	2,4-Cl(Ph)	
4.136	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	4-Cl(Ph)	2,4-F(Ph)	
4.137	Ph	4-Cl(Ph)	2-Cl(Ph)	
4.138	Ph	4-Cl(Ph)	3-Cl(Ph)	
4.139	Ph	4-Cl(Ph)	4-Cl(Ph)	
4.140	4-Cl(Ph)	4-Cl(Ph)	Ph	
4.141	4-Cl(Ph)	4-Cl(Ph)	4-Cl(Ph)	
4.142	4-F(Ph)	4-Cl(Ph)	Ph	
4.143	4-F(Ph)	4-Cl(Ph)	4-F(Ph)	
4.144	4-CF ₃ (Ph)	4-Cl(Ph)	Ph	
4.145	4-CF ₃ (Ph)	4-Cl(Ph)	4-CF ₃ (Ph)	
4.146	2,4-Cl(Ph)	4-Cl(Ph)	Ph	
4.147	2,4-Cl(Ph)	4-Cl(Ph)	2,4-Cl(Ph)	
4.148	2,4-F(Ph)	4-Cl(Ph)	Ph	
4.149	H	4-CF ₃ (Ph)	Ph	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

總

五、發明說明 (36)

表 4 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
4.150	CH ₃	4-CF ₃ (Ph)	Ph	
4.151	C ₂ H ₅	4-CF ₃ (Ph)	2-Cl(Ph)	
4.152	n-C ₃ H ₇	4-CF ₃ (Ph)	3-Cl(Ph)	
4.153	iso-C ₃ H ₇	4-CF ₃ (Ph)	4-Cl(Ph)	
4.154	n-C ₄ H ₉	4-CF ₃ (Ph)	4-Br(Ph)	
4.155	iso-C ₄ H ₉	4-CF ₃ (Ph)	4-F(Ph)	
4.156	c-C ₃ H ₅	4-CF ₃ (Ph)	4-OCH ₃ (Ph)	
4.157	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	4-CF ₃ (Ph)	4-CH ₃ (Ph)	
4.158	C(H)=N-OCH ₃	4-CF ₃ (Ph)	4-NO ₂ (Ph)	
4.159	C(CH ₃)=N-OCH ₃	4-CF ₃ (Ph)	2,4-Cl(Ph)	
4.160	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	4-CF ₃ (Ph)	2,4-F(Ph)	
4.161	Ph	4-CF ₃ (Ph)	2-Cl(Ph)	
4.162	Ph	4-CF ₃ (Ph)	3-Cl(Ph)	
4.163	Ph	4-CF ₃ (Ph)	4-Cl(Ph)	
4.164	4-Cl(Ph)	4-CF ₃ (Ph)	Ph	
4.165	4-Cl(Ph)	4-CF ₃ (Ph)	4-Cl(Ph)	
4.166	4-F(Ph)	4-CF ₃ (Ph)	Ph	
4.167	4-F(Ph)	4-CF ₃ (Ph)	4-F(Ph)	
4.168	4-CF ₃ (Ph)	4-CF ₃ (Ph)	Ph	
4.169	4-CF ₃ (Ph)	4-CF ₃ (Ph)	4-CF ₃ (Ph)	
4.170	2,4-Cl(Ph)	4-CF ₃ (Ph)	Ph	
4.171	2,4-Cl(Ph)	4-CF ₃ (Ph)	2,4-Cl(Ph)	
4.172	2,4-F(Ph)	4-CF ₃ (Ph)	Ph	
4.173	H	1-萘基	Ph	
4.174	CH ₃	1-萘基	Ph	
4.175	C ₂ H ₅	1-萘基	2-Cl(Ph)	
4.176	n-C ₃ H ₇	1-萘基	3-Cl(Ph)	
4.177	iso-C ₃ H ₇	1-萘基	4-Cl(Ph)	
4.178	n-C ₄ H ₉	1-萘基	4-Br(Ph)	
4.179	iso-C ₄ H ₉	1-萘基	4-F(Ph)	
4.180	c-C ₃ H ₅	1-萘基	4-OCH ₃ (Ph)	
4.181	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	1-萘基	4-CH ₃ (Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (37)

表 4 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
4.182	$C(H)=N-OCH_3$	1-萘基	$4-NO_2(Ph)$	
4.183	$C(CH_3)=N-OCH_3$	1-萘基	$2,4-Cl(Ph)$	
4.184	$C(C_2H_5)=N-OCH_3$	1-萘基	$2,4-F(Ph)$	
4.185	Ph	1-萘基	$2-Cl(Ph)$	
4.186	Ph	1-萘基	$3-Cl(Ph)$	
4.187	Ph	1-萘基	$4-Cl(Ph)$	
4.188	$4-Cl(Ph)$	1-萘基	Ph	
4.189	$4-Cl(Ph)$	1-萘基	$4-Cl(Ph)$	
4.190	$4-F(Ph)$	1-萘基	Ph	
4.191	$4-F(Ph)$	1-萘基	$4-F(Ph)$	
4.192	$4-CF_3(Ph)$	1-萘基	Ph	
4.193	$4-CF_3(Ph)$	1-萘基	$4-CF_3(Ph)$	
4.194	$2,4-Cl(Ph)$	1-萘基	Ph	
4.195	$2,4-Cl(Ph)$	1-萘基	$2,4-Cl(Ph)$	
4.196	$2,4-F(Ph)$	1-萘基	Ph	

表 5 :

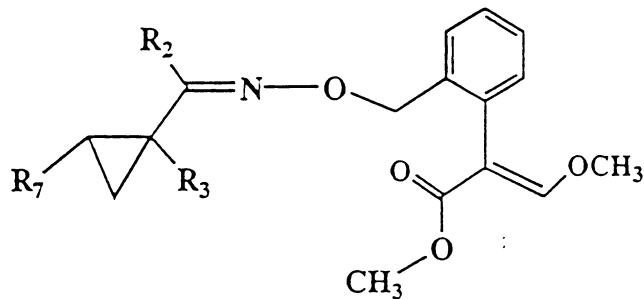
化合物 5.1 至 5.196 是式 V 化合物 ($X=N$ 且 $Z=O$)，其中取代基 R_2 ， R_3 及 R_7 表 4 所定義。

表 6 :

化合物 6.1 至 6.196 是式 VII 化合物 ($X=N$ 且 $Z=NH$)，其中取代基 R_2 ， R_3 及 R_7 表 4 所定義。

典型包括本發明之式 I (其中 $A=R_4=R_5=R_6=H$) 化合物如表 4 之式 IV ($X=CH$ 且 Z 是 O) 所示，其中 R_2 ， R_3 及 R_7 如表 7 所定義。

五、發明說明 (38)



式 IV

表 7

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
7.1	H	2-呋喃基	Ph	
7.2	H	2-呋喃基	2-Cl(Ph)	
7.3	H	2-呋喃基	3-Cl(Ph)	
7.4	H	2-呋喃基	4-Cl(Ph)	
7.5	H	2-呋喃基	4-Br(Ph)	
7.6	H	2-呋喃基	4-F(Ph)	
7.7	H	2-呋喃基	4-OCH ₃ (Ph)	
7.8	H	2-呋喃基	4-CH ₃ (Ph)	
7.9	H	2-呋喃基	4-NO ₂ (Ph)	
7.10	H	2-呋喃基	2,4-Cl(Ph)	
7.11	H	2-呋喃基	2,4-F(Ph)	
7.12	H	2-噻吩基	Ph	
7.13	H	2-噻吩基	2-Cl(Ph)	
7.14	H	2-噻吩基	3-Cl(Ph)	
7.15	H	2-噻吩基	4-Cl(Ph)	
7.16	H	2-噻吩基	4-Br(Ph)	
7.17	H	2-噻吩基	4-F(Ph)	
7.18	H	2-噻吩基	4-OCH ₃ (Ph)	
7.19	H	2-噻吩基	4-CH ₃ (Ph)	
7.20	H	2-噻吩基	4-NO ₂ (Ph)	
7.21	H	2-噻吩基	2,4-Cl(Ph)	

五、發明說明 (39)

表 7 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
7.22	H	2-噻吩基	2,4-F(Ph)	
7.23	H	2-吡啶基	Ph	
7.24	H	2-吡啶基	2-Cl(Ph)	
7.25	H	2-吡啶基	3-Cl(Ph)	
7.26	H	2-吡啶基	4-Cl(Ph)	
7.27	H	2-吡啶基	4-Br(Ph)	
7.28	H	2-吡啶基	4-F(Ph)	
7.29	H	2-吡啶基	4-OCH ₃ (Ph)	
7.30	H	2-吡啶基	4-CH ₃ (Ph)	
7.31	H	2-吡啶基	4-NO ₂ (Ph)	
7.32	H	2-吡啶基	2,4-Cl(Ph)	
7.33	H	2-吡啶基	2,4-F(Ph)	
7.34	H	3-吡啶基	Ph	
7.35	H	3-吡啶基	2-Cl(Ph)	
7.36	H	3-吡啶基	3-Cl(Ph)	
7.37	H	3-吡啶基	4-Cl(Ph)	
7.38	H	3-吡啶基	4-Br(Ph)	
7.39	H	3-吡啶基	4-F(Ph)	
7.40	H	3-吡啶基	4-OCH ₃ (Ph)	
7.41	H	3-吡啶基	4-CH ₃ (Ph)	
7.42	H	3-吡啶基	4-NO ₂ (Ph)	
7.43	H	3-吡啶基	2,4-Cl(Ph)	
7.44	H	3-吡啶基	2,4-F(Ph)	
7.45	H	4-吡啶基	Ph	
7.46	H	4-吡啶基	2-Cl(Ph)	
7.47	H	4-吡啶基	3-Cl(Ph)	
7.48	H	4-吡啶基	4-Cl(Ph)	
7.49	H	4-吡啶基	4-Br(Ph)	
7.50	H	4-吡啶基	4-F(Ph)	
7.51	H	4-吡啶基	4-OCH ₃ (Ph)	
7.52	H	4-吡啶基	4-CH ₃ (Ph)	
7.53	H	4-吡啶基	4-NO ₂ (Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (40)

表 7 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
7.54	H	4-吡啶基	2,4-Cl(Ph)	
7.55	H	4-吡啶基	2,4-F(Ph)	
7.56	H	4-吡啶基	2-Cl(Ph)	
7.57	H	4-吡啶基	3-Cl(Ph)	
7.58	H	4-吡啶基	4-Cl(Ph)	
7.59	H	4-吡啶基	4-Br(Ph)	
7.60	H	4-吡啶基	4-F(Ph)	
7.61	H	4-吡啶基	4-OCH ₃ (Ph)	
7.62	H	4-吡啶基	4-CH ₃ (Ph)	
7.63	H	4-吡啶基	4-NO ₂ (Ph)	
7.64	H	4-吡啶基	2,4-Cl(Ph)	
7.65	H	4-吡啶基	2,4-F(Ph)	
7.66	CH ₃	3-呋喃基	Ph	
7.67	CH ₃	3-呋喃基	2-Cl(Ph)	
7.68	CH ₃	3-呋喃基	3-Cl(Ph)	
7.69	CH ₃	3-呋喃基	4-Cl(Ph)	
7.70	CH ₃	3-呋喃基	4-Br(Ph)	
7.71	CH ₃	3-呋喃基	4-F(Ph)	
7.72	CH ₃	3-呋喃基	4-OCH ₃ (Ph)	
7.73	CH ₃	3-呋喃基	4-CH ₃ (Ph)	
7.74	CH ₃	3-呋喃基	4-NO ₂ (Ph)	
7.75	CH ₃	3-呋喃基	2,4-Cl(Ph)	
7.76	CH ₃	3-呋喃基	2,4-F(Ph)	
7.77	CH ₃	3-噻吩基	Ph	
7.78	CH ₃	3-噻吩基	2-Cl(Ph)	
7.79	CH ₃	3-噻吩基	3-Cl(Ph)	
7.80	CH ₃	3-噻吩基	4-Cl(Ph)	
7.81	CH ₃	3-噻吩基	4-Br(Ph)	
7.82	CH ₃	3-噻吩基	4-F(Ph)	
7.83	CH ₃	3-噻吩基	4-OCH ₃ (Ph)	
7.84	CH ₃	3-噻吩基	4-CH ₃ (Ph)	
7.85	CH ₃	3-噻吩基	4-NO ₂ (Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (41)

表 7 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
7.86	CH ₃	3-噻吩基	2,4-Cl(Ph)	
7.87	CH ₃	3-噻吩基	2,4-F(Ph)	
7.88	CH ₃	2-吡啶基	Ph	
7.89	CH ₃	2-吡啶基	2-Cl(Ph)	
7.90	CH ₃	2-吡啶基	3-Cl(Ph)	
7.91	CH ₃	2-吡啶基	4-Cl(Ph)	
7.92	CH ₃	2-吡啶基	4-Br(Ph)	
7.93	CH ₃	2-吡啶基	4-F(Ph)	
7.94	CH ₃	2-吡啶基	4-OCH ₃ (Ph)	
7.95	CH ₃	2-吡啶基	4-CH ₃ (Ph)	
7.96	CH ₃	2-吡啶基	4-NO ₂ (Ph)	
7.97	CH ₃	2-吡啶基	2,4-Cl(Ph)	
7.98	CH ₃	2-吡啶基	2,4-F(Ph)	
7.99	CH ₃	3-吡啶基	Ph	
7.100	CH ₃	3-吡啶基	2-Cl(Ph)	
7.101	CH ₃	3-吡啶基	3-Cl(Ph)	
7.102	CH ₃	3-吡啶基	4-Cl(Ph)	
7.103	CH ₃	3-吡啶基	4-Br(Ph)	
7.104	CH ₃	3-吡啶基	4-F(Ph)	
7.105	CH ₃	3-吡啶基	4-OCH ₃ (Ph)	
7.106	CH ₃	3-吡啶基	4-CH ₃ (Ph)	
7.107	CH ₃	3-吡啶基	4-NO ₂ (Ph)	
7.108	CH ₃	3-吡啶基	2,4-Cl(Ph)	
7.109	CH ₃	3-吡啶基	2,4-F(Ph)	
7.110	CH ₃	4-吡啶基	Ph	
7.111	CH ₃	4-吡啶基	2-Cl(Ph)	
7.112	CH ₃	4-吡啶基	3-Cl(Ph)	
7.113	CH ₃	4-吡啶基	4-Cl(Ph)	
7.114	CH ₃	4-吡啶基	4-Br(Ph)	
7.115	CH ₃	4-吡啶基	4-F(Ph)	
7.116	CH ₃	4-吡啶基	4-OCH ₃ (Ph)	
7.117	CH ₃	4-吡啶基	4-CH ₃ (Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (42)

表 7 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
7.118	CH ₃	4-吡啶基	4-NO ₂ (Ph)	
7.119	CH ₃	4-吡啶基	2,4-Cl(Ph)	
7.120	CH ₃	4-吡啶基	2,4-F(Ph)	
7.121	CH ₃	4-吡啶基	2-Cl(Ph)	
7.122	CH ₃	4-吡啶基	3-Cl(Ph)	
7.123	CH ₃	4-吡啶基	4-Cl(Ph)	
7.124	CH ₃	4-吡啶基	4-Br(Ph)	
7.125	CH ₃	4-吡啶基	4-F(Ph)	
7.126	CH ₃	4-吡啶基	4-OCH ₃ (Ph)	
7.127	CH ₃	4-吡啶基	4-CH ₃ (Ph)	
7.128	CH ₃	4-吡啶基	4-NO ₂ (Ph)	
7.129	CH ₃	4-吡啶基	2,4-Cl(Ph)	
7.130	CH ₃	4-吡啶基	2,4-F(Ph)	
7.131	CH ₃	4-吡啶基	Ph	
7.132	C ₂ H ₅	2-噻吩基	2-Cl(Ph)	
7.133	n-C ₃ H ₇	2-噻吩基	3-Cl(Ph)	
7.134	iso-C ₃ H ₇	2-噻吩基	4-Cl(Ph)	
7.135	n-C ₄ H ₉	2-噻吩基	4-Br(Ph)	
7.136	iso-C ₄ H ₉	2-噻吩基	4-F(Ph)	
7.137	c-C ₃ H ₅	2-噻吩基	4-OCH ₃ (Ph)	
7.138	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	2-噻吩基	4-CH ₃ (Ph)	
7.139	C(H)=N-OCH ₃	2-噻吩基	4-NO ₂ (Ph)	
7.140	C(CH ₃)=N-OCH ₃	2-噻吩基	2,4-Cl(Ph)	
7.141	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	2-噻吩基	2,4-F(Ph)	
7.142	Ph	2-噻吩基	2-Cl(Ph)	
7.143	Ph	2-噻吩基	3-Cl(Ph)	
7.144	Ph	2-噻吩基	4-Cl(Ph)	
7.145	4-Cl(Ph)	2-噻吩基	Ph	
7.146	4-Cl(Ph)	2-噻吩基	4-Cl(Ph)	
7.147	4-F(Ph)	2-噻吩基	Ph	
7.148	4-F(Ph)	2-噻吩基	4-Cl(Ph)	
7.149	4-CF ₃ (Ph)	2-噻吩基	Ph	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

總

五、發明說明 (43)

表 7 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
7.150	4-CF ₃ (Ph)	2-噻吩基	4-CF ₃ (Ph)	
7.151	2,4-Cl(Ph)	2-噻吩基	Ph	
7.152	2,4-Cl(Ph)	2-噻吩基	2,4-Cl(Ph)	
7.153	2,4-F(Ph)	2-噻吩基	Ph	
7.154	C ₂ H ₅	2-吡啶基	2-Cl(Ph)	
7.155	n-C ₃ H ₇	2-吡啶基	3-Cl(Ph)	
7.156	iso-C ₃ H ₇	2-吡啶基	4-Cl(Ph)	
7.157	n-C ₄ H ₉	2-吡啶基	4-Br(Ph)	
7.158	iso-C ₄ H ₉	2-吡啶基	4-F(Ph)	
7.159	c-C ₃ H ₅	2-吡啶基	4-OCH ₃ (Ph)	
7.160	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	2-吡啶基	4-CH ₃ (Ph)	
7.161	C(H)=N-OCH ₃	2-吡啶基	4-NO ₂ (Ph)	
7.162	C(CH ₃)=N-OCH ₃	2-吡啶基	2,4-Cl(Ph)	
7.163	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	2-吡啶基	2,4-F(Ph)	
7.164	Ph	2-吡啶基	2-Cl(Ph)	
7.165	Ph	2-吡啶基	3-Cl(Ph)	
7.166	Ph	2-吡啶基	4-Cl(Ph)	
7.167	4-Cl(Ph)	2-吡啶基	Ph	
7.168	4-Cl(Ph)	2-吡啶基	4-Cl(Ph)	
7.169	4-F(Ph)	2-吡啶基	Ph	
7.170	4-F(Ph)	2-吡啶基	4-F(Ph)	
7.171	4-CF ₃ (Ph)	2-吡啶基	Ph	
7.172	4-CF ₃ (Ph)	2-吡啶基	4-CF ₃ (Ph)	
7.173	2,4-Cl(Ph)	2-吡啶基	Ph	
7.174	2,4-Cl(Ph)	2-吡啶基	2,4-Cl(Ph)	
7.175	2,4-F(Ph)	2-吡啶基	Ph	
7.176	C ₂ H ₅	4-吡啶基	2-Cl(Ph)	
7.177	n-C ₃ H ₇	4-吡啶基	3-Cl(Ph)	
7.178	iso-C ₃ H ₇	4-吡啶基	4-Cl(Ph)	
7.179	n-C ₄ H ₉	4-吡啶基	4-Br(Ph)	
7.180	iso-C ₄ H ₉	4-吡啶基	4-F(Ph)	
7.181	c-C ₃ H ₅	4-吡啶基	4-OCH ₃ (Ph)	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (44)

表 7 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
7.182	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	4-吡啶基	4-CH ₃ (Ph)	
7.183	C(H)=N-OCH ₃	4-吡啶基	4-NO ₂ (Ph)	
7.184	C(CH ₃)=N-OCH ₃	4-吡啶基	2,4-Cl(Ph)	
7.185	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	4-吡啶基	2,4-F(Ph)	
7.186	Ph	4-吡啶基	2-Cl(Ph)	
7.187	Ph	4-吡啶基	3-Cl(Ph)	
7.188	Ph	4-吡啶基	4-Cl(Ph)	
7.189	4-Cl(Ph)	4-吡啶基	Ph	
7.190	4-Cl(Ph)	4-吡啶基	4-Cl(Ph)	
7.191	4-F(Ph)	4-吡啶基	Ph	
7.192	4-F(Ph)	4-吡啶基	4-F(Ph)	
7.193	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	Ph	
7.194	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	4-CF ₃ (Ph)	
7.195	2,4-Cl(Ph)	4-吡啶基	Ph	
7.196	2,4-Cl(Ph)	4-吡啶基	2,4-Cl(Ph)	
7.197	2,4-F(Ph)	4-吡啶基	Ph	

表 8 :

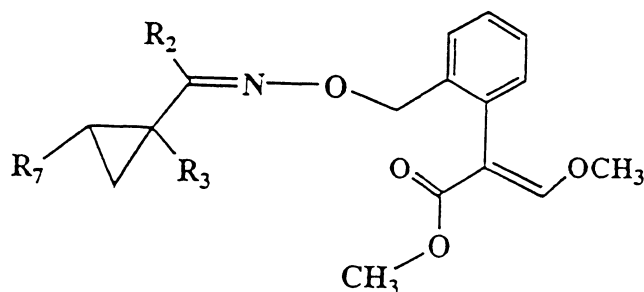
化合物 8.001 至 8.197 是式 V 化合物 (X=N 且 Z=O)，其中取代基 R₂，R₃ 及 R₇ 如表 7 所定義。

表 9 :

化合物 8.001 至 8.197 是式 VII 化合物 (X=N 且 Z=NH)，其中取代基 R₂，R₃ 及 R₇ 如表 7 所定義。

典型的包括本發明之式 I (其中 A=R₄=R₅=R₆=H) 化合物如表 10 之式 IV (X=CH 且 Z 是 O) 所示，其中 R₂，R₃ 及 R₇ 如表 10 所定義。

五、發明說明 (45)



式 IV

表 10

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
10.1	H	H	2-呋喃基	
10.2	CH ₃	H	2-呋喃基	
10.3	C ₂ H ₅	H	2-呋喃基	
10.4	n-C ₃ H ₇	H	2-呋喃基	
10.5	iso-C ₃ H ₇	H	2-呋喃基	
10.6	n-C ₄ H ₉	H	2-呋喃基	
10.7	iso-C ₄ H ₉	H	2-呋喃基	
10.8	c-C ₃ H ₅	H	2-呋喃基	
10.9	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2-呋喃基	
10.10	C(H)=N-OCH ₃	H	2-呋喃基	
10.11	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2-呋喃基	
10.12	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2-呋喃基	
10.13	Ph	H	2-呋喃基	
10.14	2-Cl(Ph)	H	2-呋喃基	
10.15	3-Cl(Ph)	H	2-呋喃基	
10.16	4-Cl(Ph)	H	2-呋喃基	
10.17	2-F(Ph)	H	2-呋喃基	
10.18	3-F(Ph)	H	2-呋喃基	
10.19	4-F(Ph)	H	2-呋喃基	
10.20	2-CF ₃ (Ph)	H	2-呋喃基	
10.21	3-CF ₃ (Ph)	H	2-呋喃基	

五、發明說明 (46)

表 10 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
10.22	4-CF ₃ (Ph)	H	2-呋喃基	
10.23	2,4-Cl(Ph)	H	2-呋喃基	
10.24	2,4-F(Ph)	H	2-呋喃基	
10.25	H	H	3-呋喃基	
10.26	CH ₃	H	3-呋喃基	
10.27	C ₂ H ₅	H	3-呋喃基	
10.28	n-C ₃ H ₇	H	3-呋喃基	
10.29	iso-C ₃ H ₇	H	3-呋喃基	
10.30	n-C ₄ H ₉	H	3-呋喃基	
10.31	iso-C ₄ H ₉	H	3-呋喃基	
10.32	c-C ₃ H ₅	H	3-呋喃基	
10.33	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	3-呋喃基	
10.34	C(H)=N-OCH ₃	H	3-呋喃基	
10.35	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	3-呋喃基	
10.36	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	3-呋喃基	
10.37	Ph	H	3-呋喃基	
10.38	2-Cl(Ph)	H	3-呋喃基	
10.39	3-Cl(Ph)	H	3-呋喃基	
10.40	4-Cl(Ph)	H	3-呋喃基	
10.41	2-F(Ph)	H	3-呋喃基	
10.42	3-F(Ph)	H	3-呋喃基	
10.43	4-F(Ph)	H	3-呋喃基	
10.44	2-CF ₃ (Ph)	H	3-呋喃基	
10.45	3-CF ₃ (Ph)	H	3-呋喃基	
10.46	4-CF ₃ (Ph)	H	3-呋喃基	
10.47	2,4-Cl(Ph)	H	3-呋喃基	
10.48	2,4-F(Ph)	H	3-呋喃基	
10.49	H	H	2-噻吩基	
10.50	CH ₃	H	2-噻吩基	
10.51	C ₂ H ₅	H	2-噻吩基	
10.52	n-C ₃ H ₇	H	2-噻吩基	
10.53	iso-C ₃ H ₇	H	2-噻吩基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (47)

表 10 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
10.54	n-C ₄ H ₉	H	2-噻吩基	
10.55	iso-C ₄ H ₉	H	2-噻吩基	
10.56	c-C ₃ H ₅	H	2-噻吩基	
10.57	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2-噻吩基	
10.58	C(H)=N-OCH ₃	H	2-噻吩基	
10.59	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2-噻吩基	
10.60	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2-噻吩基	
10.61	Ph	H	2-噻吩基	
10.62	2-Cl(Ph)	H	2-噻吩基	
10.63	3-Cl(Ph)	H	2-噻吩基	
10.64	4-Cl(Ph)	H	2-噻吩基	
10.65	2-F(Ph)	H	2-噻吩基	
10.66	3-F(Ph)	H	2-噻吩基	
10.67	4-F(Ph)	H	2-噻吩基	
10.68	2-CF ₃ (Ph)	H	2-噻吩基	
10.69	3-CF ₃ (Ph)	H	2-噻吩基	
10.70	4-CF ₃ (Ph)	H	2-噻吩基	
10.71	2,4-Cl(Ph)	H	2-噻吩基	
10.72	2,4-F(Ph)	H	2-噻吩基	
10.73	H	H	3-噻吩基	
10.74	CH ₃	H	3-噻吩基	
10.75	C ₂ H ₅	H	3-噻吩基	
10.76	n-C ₃ H ₇	H	3-噻吩基	
10.77	iso-C ₃ H ₇	H	3-噻吩基	
10.78	n-C ₄ H ₉	H	3-噻吩基	
10.79	iso-C ₄ H ₉	H	3-噻吩基	
10.80	c-C ₃ H ₅	H	3-噻吩基	
10.81	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	3-噻吩基	
10.82	C(H)=N-OCH ₃	H	3-噻吩基	
10.83	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	3-噻吩基	
10.84	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	3-噻吩基	
10.85	Ph	H	3-噻吩基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (48)

表 10 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
10.86	2-Cl(Ph)	H	3-噻吩基	
10.87	3-Cl(Ph)	H	3-噻吩基	
10.88	4-Cl(Ph)	H	3-噻吩基	
10.89	2-F(Ph)	H	3-噻吩基	
10.90	3-F(Ph)	H	3-噻吩基	
10.91	4-F(Ph)	H	3-噻吩基	
10.92	2-CF ₃ (Ph)	H	3-噻吩基	
10.93	3-CF ₃ (Ph)	H	3-噻吩基	
10.94	4-CF ₃ (Ph)	H	3-噻吩基	
10.95	2,4-Cl(Ph)	H	3-噻吩基	
10.96	2,4-F(Ph)	H	3-噻吩基	
10.97	H	H	2-吡啶基	
10.98	CH ₃	H	2-吡啶基	
10.99	C ₂ H ₅	H	2-吡啶基	
10.100	n-C ₃ H ₇	H	2-吡啶基	
10.101	iso-C ₃ H ₇	H	2-吡啶基	
10.102	n-C ₄ H ₉	H	2-吡啶基	
10.103	iso-C ₄ H ₉	H	2-吡啶基	
10.104	c-C ₃ H ₅	H	2-吡啶基	
10.105	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2-吡啶基	
10.106	C(H)=N-OCH ₃	H	2-吡啶基	
10.107	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2-吡啶基	
10.108	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2-吡啶基	
10.109	Ph	H	2-吡啶基	
10.110	2-Cl(Ph)	H	2-吡啶基	
10.111	3-Cl(Ph)	H	2-吡啶基	
10.112	4-Cl(Ph)	H	2-吡啶基	
10.113	2-F(Ph)	H	2-吡啶基	
10.114	3-F(Ph)	H	2-吡啶基	
10.115	4-F(Ph)	H	2-吡啶基	
10.116	2-CF ₃ (Ph)	H	2-吡啶基	
10.117	3-CF ₃ (Ph)	H	2-吡啶基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (49)

表 10 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
10.118	4-CF ₃ (Ph)	H	2-吡啶基	
10.119	2,4-Cl(Ph)	H	2-吡啶基	
10.120	2,4-F(Ph)	H	3-吡啶基	
10.121	H	H	3-吡啶基	
10.122	CH ₃	H	3-吡啶基	
10.123	C ₂ H ₅	H	3-吡啶基	
10.124	n-C ₃ H ₇	H	3-吡啶基	
10.125	iso-C ₃ H ₇	H	3-吡啶基	
10.126	n-C ₄ H ₉	H	3-吡啶基	
10.127	iso-C ₄ H ₉	H	3-吡啶基	
10.128	c-C ₃ H ₅	H	3-吡啶基	
10.129	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	3-吡啶基	
10.130	C(H)=N-OCH ₃	H	3-吡啶基	
10.131	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	3-吡啶基	
10.132	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	3-吡啶基	
10.133	Ph	H	3-吡啶基	
10.134	2-Cl(Ph)	H	3-吡啶基	
10.135	3-Cl(Ph)	H	3-吡啶基	
10.136	4-Cl(Ph)	H	3-吡啶基	
10.137	2-F(Ph)	H	3-吡啶基	
10.138	3-F(Ph)	H	3-吡啶基	
10.139	4-F(Ph)	H	3-吡啶基	
10.140	2-CF ₃ (Ph)	H	3-吡啶基	
10.141	3-CF ₃ (Ph)	H	3-吡啶基	
10.142	4-CF ₃ (Ph)	H	3-吡啶基	
10.143	2,4-Cl(Ph)	H	3-吡啶基	
10.144	2,4-F(Ph)	H	3-吡啶基	
10.145	H	H	4-吡啶基	
10.146	CH ₃	H	4-吡啶基	
10.147	C ₂ H ₅	H	4-吡啶基	
10.148	n-C ₃ H ₇	H	4-吡啶基	
10.149	iso-C ₃ H ₇	H	4-吡啶基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

線

五、發明說明 (50)

表 10 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
10.150	n-C ₄ H ₉	H	4-吡啶基	
10.151	iso-C ₄ H ₉	H	4-吡啶基	
10.152	c-C ₃ H ₅	H	4-吡啶基	
10.153	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-吡啶基	
10.154	C(H)=N-OCH ₃	H	4-吡啶基	
10.155	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	4-吡啶基	
10.156	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	4-吡啶基	
10.157	Ph	H	4-吡啶基	
10.158	2-Cl(Ph)	H	4-吡啶基	
10.159	3-Cl(Ph)	H	4-吡啶基	
10.160	4-Cl(Ph)	H	4-吡啶基	
10.161	2-F(Ph)	H	4-吡啶基	
10.162	3-F(Ph)	H	4-吡啶基	
10.163	4-F(Ph)	H	4-吡啶基	
10.164	2-CF ₃ (Ph)	H	4-吡啶基	
10.165	3-CF ₃ (Ph)	H	4-吡啶基	
10.166	4-CF ₃ (Ph)	H	4-吡啶基	
10.167	2,4-Cl(Ph)	H	4-吡啶基	
10.168	2,4-F(Ph)	H	4-吡啶基	
10.169	H	H	吡嗪基	
10.170	CH ₃	H	吡嗪基	
10.171	C ₂ H ₅	H	吡嗪基	
10.172	n-C ₃ H ₇	H	吡嗪基	
10.173	iso-C ₃ H ₇	H	吡嗪基	
10.174	n-C ₄ H ₉	H	吡嗪基	
10.175	iso-C ₄ H ₉	H	吡嗪基	
10.176	c-C ₃ H ₅	H	吡嗪基	
10.177	H	H	喹啉-4-基	
10.178	CH ₃	H	喹啉-4-基	
10.179	C ₂ H ₅	H	喹啉-4-基	
10.180	n-C ₃ H ₇	H	喹啉-4-基	
10.181	iso-C ₃ H ₇	H	喹啉-4-基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (51)

表 10 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
10.182	n-C ₄ H ₉	H	喹啉-4-基	
10.183	iso-C ₄ H ₉	H	喹啉-4-基	
10.184	c-C ₃ H ₅	H	喹啉-4-基	
10.185	H	CH ₃	2-呋喃基	
10.186	CH ₃	CH ₃	2-呋喃基	
10.187	C ₂ H ₅	CH ₃	2-呋喃基	
10.188	n-C ₃ H ₇	CH ₃	2-呋喃基	
10.189	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	2-呋喃基	
10.190	n-C ₄ H ₉	CH ₃	2-呋喃基	
10.191	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	2-呋喃基	
10.192	c-C ₃ H ₅	CH ₃	2-呋喃基	
10.193	H	CH ₃	3-呋喃基	
10.194	CH ₃	CH ₃	3-呋喃基	
10.195	C ₂ H ₅	CH ₃	3-呋喃基	
10.196	n-C ₃ H ₇	CH ₃	3-呋喃基	
10.197	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	3-呋喃基	
10.198	n-C ₄ H ₉	CH ₃	3-呋喃基	
10.199	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	3-呋喃基	
10.200	c-C ₃ H ₅	CH ₃	3-呋喃基	
10.201	H	CH ₃	2-噻吩基	
10.202	CH ₃	CH ₃	2-噻吩基	
10.203	C ₂ H ₅	CH ₃	2-噻吩基	
10.204	n-C ₃ H ₇	CH ₃	2-噻吩基	
10.205	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	2-噻吩基	
10.206	n-C ₄ H ₉	CH ₃	2-噻吩基	
10.207	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	2-噻吩基	
10.208	c-C ₃ H ₅	CH ₃	2-噻吩基	
10.209	H	CH ₃	3-噻吩基	
10.210	CH ₃	CH ₃	3-噻吩基	
10.211	C ₂ H ₅	CH ₃	3-噻吩基	
10.212	n-C ₃ H ₇	CH ₃	3-噻吩基	
10.213	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	3-噻吩基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

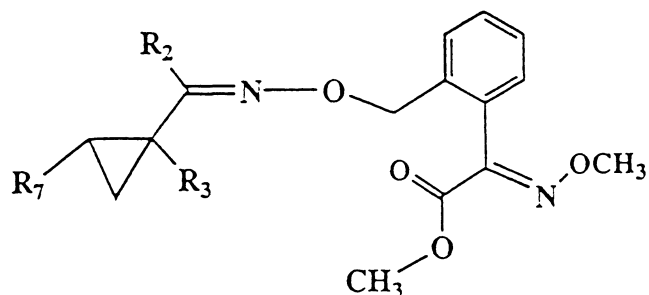
五、發明說明 (52)

表 10 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
10.214	n-C ₄ H ₉	CH ₃	3-噻吩基	
10.215	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	3-噻吩基	
10.216	c-C ₃ H ₅	CH ₃	3-噻吩基	
10.217	H	CH ₃	2-吡啶基	
10.218	CH ₃	CH ₃	2-吡啶基	
10.219	C ₂ H ₅	CH ₃	2-吡啶基	
10.220	n-C ₃ H ₇	CH ₃	2-吡啶基	
10.221	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	2-吡啶基	
10.222	n-C ₄ H ₉	CH ₃	2-吡啶基	
10.223	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	2-吡啶基	
10.224	c-C ₃ H ₅	CH ₃	2-吡啶基	
10.225	H	CH ₃	3-吡啶基	
10.226	CH ₃	CH ₃	3-吡啶基	
10.227	C ₂ H ₅	CH ₃	3-吡啶基	
10.228	n-C ₃ H ₇	CH ₃	3-吡啶基	
10.229	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	3-吡啶基	
10.230	n-C ₄ H ₉	CH ₃	3-吡啶基	
10.231	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	3-吡啶基	
10.232	c-C ₃ H ₅	CH ₃	3-吡啶基	
10.233	H	CH ₃	4-吡啶基	
10.234	CH ₃	CH ₃	4-吡啶基	
10.235	C ₂ H ₅	CH ₃	4-吡啶基	
10.236	n-C ₃ H ₇	CH ₃	4-吡啶基	
10.237	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	4-吡啶基	
10.238	n-C ₄ H ₉	CH ₃	4-吡啶基	
10.239	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	4-吡啶基	
10.240	c-C ₃ H ₅	CH ₃	4-吡啶基	

典型的包括本發明之式 I (其中 $\overline{A}=R_4=R_5=R_6=H$) 化合物如表 11 之式 V (X=N 且 Z 是 O) 所示，其中 R_2 ， R_3 及 R_7 如表 11 所定義。

五、發明說明 (53)



式 V

表 11

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
11.1	H	H	2-呋喃基	
11.2A	CH ₃	H	2-呋喃基	油狀物，異構物A
11.2B	CH ₃	H	2-呋喃基	油狀物，異構物B
11.3	C ₂ H ₅	H	2-呋喃基	
11.4	n-C ₃ H ₇	H	2-呋喃基	
11.5	iso-C ₃ H ₇	H	2-呋喃基	
11.6	n-C ₄ H ₉	H	2-呋喃基	
11.7	iso-C ₄ H ₉	H	2-呋喃基	
11.8	c-C ₃ H ₅	H	2-呋喃基	
11.9	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2-呋喃基	
11.10	C(H)=N-OCH ₃	H	2-呋喃基	
11.11	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2-呋喃基	
11.12	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2-呋喃基	
11.13	Ph	H	2-呋喃基	
11.14	2-Cl(Ph)	H	2-呋喃基	
11.15	3-Cl(Ph)	H	2-呋喃基	
11.16	4-Cl(Ph)	H	2-呋喃基	
11.17	2-F(Ph)	H	2-呋喃基	
11.18	3-F(Ph)	H	2-呋喃基	
11.19	4-F(Ph)	H	2-呋喃基	
11.20	2-CF ₃ (Ph)	H	2-呋喃基	
11.21	3-CF ₃ (Ph)	H	2-呋喃基	

五、發明說明 (54)

表 11 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
11.22	4-CF ₃ (Ph)	H	2-呋喃基	
11.23	2,4-Cl(Ph)	H	2-呋喃基	
11.24	2,4-F(Ph)	H	2-呋喃基	
11.25	H	H	3-呋喃基	
11.26	CH ₃	H	3-呋喃基	
11.27	C ₂ H ₅	H	3-呋喃基	
11.28	n-C ₃ H ₇	H	3-呋喃基	
11.29	iso-C ₃ H ₇	H	3-呋喃基	
11.30	n-C ₄ H ₉	H	3-呋喃基	
11.31	iso-C ₄ H ₉	H	3-呋喃基	
11.32	c-C ₃ H ₅	H	3-呋喃基	
11.33	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	3-呋喃基	
11.34	C(H)=N-OCH ₃	H	3-呋喃基	
11.35	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	3-呋喃基	
11.36	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	3-呋喃基	
11.37	Ph	H	3-呋喃基	
11.38	2-Cl(Ph)	H	3-呋喃基	
11.39	3-Cl(Ph)	H	3-呋喃基	
11.40	4-Cl(Ph)	H	3-呋喃基	
11.41	2-F(Ph)	H	3-呋喃基	
11.42	3-F(Ph)	H	3-呋喃基	
11.43	4-F(Ph)	H	3-呋喃基	
11.44	2-CF ₃ (Ph)	H	3-呋喃基	
11.45	3-CF ₃ (Ph)	H	3-呋喃基	
11.46	4-CF ₃ (Ph)	H	3-呋喃基	
11.47	2,4-Cl(Ph)	H	3-呋喃基	
11.48	2,4-F(Ph)	H	3-呋喃基	
11.49	H	H	2-噻吩基	
11.50A	CH ₃	H	2-噻吩基	油狀物，異構物A
11.50B	CH ₃		2-噻吩基	油狀物，異構物B
11.51	C ₂ H ₅	H	2-噻吩基	
11.52	n-C ₃ H ₇	H	2-噻吩基	
11.53	iso-C ₃ H ₇	H	2-噻吩基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

46

五、發明說明 (55)

表 11 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
11.54	n-C ₄ H ₉	H	2-噻吩基	
11.55	iso-C ₄ H ₉	H	2-噻吩基	
11.56	c-C ₃ H ₅	H	2-噻吩基	
11.57	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2-噻吩基	
11.58	C(H)=N-OCH ₃	H	2-噻吩基	
11.59	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2-噻吩基	
11.60	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2-噻吩基	
11.61	Ph	H	2-噻吩基	
11.62	2-Cl(Ph)	H	2-噻吩基	
11.63	3-Cl(Ph)	H	2-噻吩基	
11.64	4-Cl(Ph)	H	2-噻吩基	
11.65	2-F(Ph)	H	2-噻吩基	
11.66	3-F(Ph)	H	2-噻吩基	
11.67	4-F(Ph)	H	2-噻吩基	
11.68	2-CF ₃ (Ph)	H	2-噻吩基	
11.69	3-CF ₃ (Ph)	H	2-噻吩基	
11.70	4-CF ₃ (Ph)	H	2-噻吩基	
11.71	2,4-Cl(Ph)	H	2-噻吩基	
11.72	2,4-F(Ph)	H	2-噻吩基	
11.73	H	H	3-噻吩基	
11.74	CH ₃	H	3-噻吩基	
11.75	C ₂ H ₅	H	3-噻吩基	
11.76	n-C ₃ H ₇	H	3-噻吩基	
11.77	iso-C ₃ H ₇	H	3-噻吩基	
11.78	n-C ₄ H ₉	H	3-噻吩基	
11.79	iso-C ₄ H ₉	H	3-噻吩基	
11.80	c-C ₃ H ₅	H	3-噻吩基	
11.81	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	3-噻吩基	
11.82	C(H)=N-OCH ₃	H	3-噻吩基	
11.83	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	3-噻吩基	
11.84	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	3-噻吩基	
11.85	Ph	H	3-噻吩基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

編

五、發明說明 (56)

表 11 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
11.86	2-Cl(Ph)	H	3-噻吩基	
11.87	3-Cl(Ph)	H	3-噻吩基	
11.88	4-Cl(Ph)	H	3-噻吩基	
11.89	2-F(Ph)	H	3-噻吩基	
11.90	3-F(Ph)	H	3-噻吩基	
11.91	4-F(Ph)	H	3-噻吩基	
11.92	2-CF ₃ (Ph)	H	3-噻吩基	
11.93	3-CF ₃ (Ph)	H	3-噻吩基	
11.94	4-CF ₃ (Ph)	H	3-噻吩基	
11.95	2,4-Cl(Ph)	H	3-噻吩基	
11.96	2,4-F(Ph)	H	3-噻吩基	
11.97	H	H	2-吡啶基	
11.98A	CH ₃	H	2-吡啶基	油狀物，異構物A
11.98B	CH ₃	H	2-吡啶基	油狀物，異構物B
11.99	C ₂ H ₅	H	2-吡啶基	
11.100	n-C ₃ H ₇	H	2-吡啶基	
11.101	iso-C ₃ H ₇	H	2-吡啶基	
11.102	n-C ₄ H ₉	H	2-吡啶基	
11.103	iso-C ₄ H ₉	H	2-吡啶基	
11.104	c-C ₃ H ₅	H	2-吡啶基	
11.105	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2-吡啶基	
11.106	C(H)=N-OCH ₃	H	2-吡啶基	
11.107	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2-吡啶基	
11.108	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2-吡啶基	
11.109	Ph	H	2-吡啶基	
11.110	2-Cl(Ph)	H	2-吡啶基	
11.111	3-Cl(Ph)	H	2-吡啶基	
11.112	4-Cl(Ph)	H	2-吡啶基	
11.113	2-F(Ph)	H	2-吡啶基	
11.114	3-F(Ph)	H	2-吡啶基	
11.115	4-F(Ph)	H	2-吡啶基	
11.116	2-CF ₃ (Ph)	H	2-吡啶基	
11.117	3-CF ₃ (Ph)	H	2-吡啶基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

編

五、發明說明 (57)

表 11 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
11.118	4-CF ₃ (Ph)	H	2-吡啶基	
11.119	2,4-Cl(Ph)	H	2-吡啶基	
11.120	2,4-F(Ph)	H	2-吡啶基	
11.121	H	H	3-吡啶基	
11.121A	CH ₃	H	3-吡啶基	油狀物，異構物A
11.121B	CH ₃	H	3-吡啶基	油狀物，異構物B
11.123	C ₂ H ₅	H	3-吡啶基	
11.124	n-C ₃ H ₇	H	3-吡啶基	
11.125	iso-C ₃ H ₇	H	3-吡啶基	
11.126	n-C ₄ H ₉	H	3-吡啶基	
11.127	iso-C ₄ H ₉	H	3-吡啶基	
11.128	c-C ₃ H ₅	H	3-吡啶基	
11.129	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	3-吡啶基	
11.130	C(H)=N-OCH ₃	H	3-吡啶基	
11.131	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	3-吡啶基	
11.132	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	3-吡啶基	
11.133	Ph	H	3-吡啶基	
11.134	2-Cl(Ph)	H	3-吡啶基	
11.135	3-Cl(Ph)	H	3-吡啶基	
11.136	4-Cl(Ph)	H	3-吡啶基	
11.137	2-F(Ph)	H	3-吡啶基	
11.138	3-F(Ph)	H	3-吡啶基	
11.139	4-F(Ph)	H	3-吡啶基	
11.140	2-CF ₃ (Ph)	H	3-吡啶基	
11.141	3-CF ₃ (Ph)	H	3-吡啶基	
11.142	4-CF ₃ (Ph)	H	3-吡啶基	
11.143	2,4-Cl(Ph)	H	3-吡啶基	
11.144	2,4-F(Ph)	H	3-吡啶基	
11.145	H	H	4-吡啶基	
11.146	CH ₃	H	4-吡啶基	
11.147	C ₂ H ₅	H	4-吡啶基	
11.148	n-C ₃ H ₇	H	4-吡啶基	
11.149	iso-C ₃ H ₇	H	4-吡啶基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

裝

五、發明說明 (58)

表 11 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
11.150	n-C ₄ H ₉	H	4-吡啶基	
11.151	iso-C ₄ H ₉	H	4-吡啶基	
11.152	c-C ₃ H ₅	H	4-吡啶基	
11.153	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-吡啶基	
11.154	C(H)=N-OCH ₃	H	4-吡啶基	
11.155	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	4-吡啶基	
11.156	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	4-吡啶基	
11.157	Ph	H	4-吡啶基	
11.158	2-Cl(Ph)	H	4-吡啶基	
11.159	3-Cl(Ph)	H	4-吡啶基	
11.160	4-Cl(Ph)	H	4-吡啶基	
11.161	2-F(Ph)	H	4-吡啶基	
11.162	3-F(Ph)	H	4-吡啶基	
11.163	4-F(Ph)	H	4-吡啶基	
11.164	2-CF ₃ (Ph)	H	4-吡啶基	
11.165	3-CF ₃ (Ph)	H	4-吡啶基	
11.166	4-CF ₃ (Ph)	H	4-吡啶基	
11.167	2,4-Cl(Ph)	H	4-吡啶基	
11.168	2,4-F(Ph)	H	4-吡啶基	
11.169	H	H	吡嗪基	
11.170	CH ₃	H	吡嗪基	
11.171	C ₂ H ₅	H	吡嗪基	
11.172	n-C ₃ H ₇	H	吡嗪基	
11.173	iso-C ₃ H ₇	H	吡嗪基	
11.174	n-C ₄ H ₉	H	吡嗪基	
11.175	iso-C ₄ H ₉	H	吡嗪基	
11.176	c-C ₃ H ₅	H	吡嗪基	
11.177	H	H	喹啉-4-基	
11.178	CH ₃	H	喹啉-4-基	
11.179	C ₂ H ₅	H	喹啉-4-基	
11.180	n-C ₃ H ₇	H	喹啉-4-基	
11.181	iso-C ₃ H ₇	H	喹啉-4-基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

編

五、發明說明 (59)

表 11 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
11.182	n-C ₄ H ₉	H	喹啉-4-基	
11.183	iso-C ₄ H ₉	H	喹啉-4-基	
11.184	c-C ₃ H ₅	H	喹啉-4-基	
11.185	H	CH ₃	2-呋喃基	
11.186	CH ₃	CH ₃	2-呋喃基	
11.187	C ₂ H ₅	CH ₃	2-呋喃基	
11.188	n-C ₃ H ₇	CH ₃	2-呋喃基	
11.189	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	2-呋喃基	
11.190	n-C ₄ H ₉	CH ₃	2-呋喃基	
11.191	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	2-呋喃基	
11.192	c-C ₃ H ₅	CH ₃	2-呋喃基	
11.193	H	CH ₃	3-呋喃基	
11.194	CH ₃	CH ₃	3-呋喃基	
11.195	C ₂ H ₅	CH ₃	3-呋喃基	
11.196	n-C ₃ H ₇	CH ₃	3-呋喃基	
11.197	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	3-呋喃基	
11.198	n-C ₄ H ₉	CH ₃	3-呋喃基	
11.199	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	3-呋喃基	
11.200	c-C ₃ H ₅	CH ₃	3-呋喃基	
11.201	H	CH ₃	2-噻吩基	
11.202	CH ₃	CH ₃	2-噻吩基	
11.203	C ₂ H ₅	CH ₃	2-噻吩基	
11.204	n-C ₃ H ₇	CH ₃	2-噻吩基	
11.205	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	2-噻吩基	
11.206	n-C ₄ H ₉	CH ₃	2-噻吩基	
11.207	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	2-噻吩基	
11.208	c-C ₃ H ₅	CH ₃	2-噻吩基	
11.209	H	CH ₃	3-噻吩基	
11.210	CH ₃	CH ₃	3-噻吩基	
11.211	C ₂ H ₅	CH ₃	3-噻吩基	
11.212	n-C ₃ H ₇	CH ₃	3-噻吩基	
11.213	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	3-噻吩基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

編

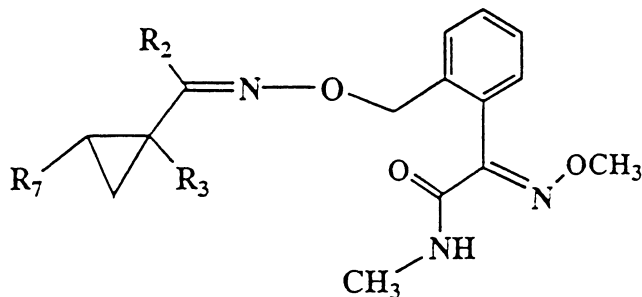
五、發明說明 (60)

表 11 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
11.214	n-C ₄ H ₉	CH ₃	3-噻吩基	
11.215	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	3-噻吩基	
11.216	c-C ₃ H ₅	CH ₃	3-噻吩基	
11.217	H	CH ₃	2-吡啶基	
11.218	CH ₃	CH ₃	2-吡啶基	
11.219	C ₂ H ₅	CH ₃	2-吡啶基	
11.220	n-C ₃ H ₇	CH ₃	2-吡啶基	
11.221	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	2-吡啶基	
11.222	n-C ₄ H ₉	CH ₃	2-吡啶基	
11.223	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	2-吡啶基	
11.224	c-C ₃ H ₅	CH ₃	2-吡啶基	
11.225	H	CH ₃	3-吡啶基	
11.226	CH ₃	CH ₃	3-吡啶基	
11.227	C ₂ H ₅	CH ₃	3-吡啶基	
11.228	n-C ₃ H ₇	CH ₃	3-吡啶基	
11.229	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	3-吡啶基	
11.230	n-C ₄ H ₉	CH ₃	3-吡啶基	
11.231	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	3-吡啶基	
11.232	c-C ₃ H ₅	CH ₃	3-吡啶基	
11.233	H	CH ₃	4-吡啶基	
11.234	CH ₃	CH ₃	4-吡啶基	
11.235	C ₂ H ₅	CH ₃	4-吡啶基	
11.236	n-C ₃ H ₇	CH ₃	4-吡啶基	
11.237	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	4-吡啶基	
11.238	n-C ₄ H ₉	CH ₃	4-吡啶基	
11.239	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	4-吡啶基	
11.240	c-C ₃ H ₅	CH ₃	4-吡啶基	

典型的包括本發明之式 I (其中 $\overline{A} = R_4 = R_5 = R_6 = H$) 化合物如表 12 之式 V (X=N 且 Z 是 O) 所示, 其中 R_2 、 R_3 及 R_7 如表 12 所定義。

五、發明說明 (61)



式 VII

表 1 2

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
12.1	H	H	2-呋喃基	
12.2A	CH ₃	H	2-呋喃基	油狀物，異構物A
12.2B	CH ₃	H	2-呋喃基	油狀物，異構物B
12.3	C ₂ H ₅	H	2-呋喃基	
12.4	n-C ₃ H ₇	H	2-呋喃基	
12.5	iso-C ₃ H ₇	H	2-呋喃基	
12.6	n-C ₄ H ₉	H	2-呋喃基	
12.7	iso-C ₄ H ₉	H	2-呋喃基	
12.8	c-C ₃ H ₅	H	2-呋喃基	
12.9	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2-呋喃基	
12.10	C(H)=N-OCH ₃	H	2-呋喃基	
12.11	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2-呋喃基	
12.12	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2-呋喃基	
12.13	Ph	H	2-呋喃基	
12.14	2-Cl(Ph)	H	2-呋喃基	
12.15	3-Cl(Ph)	H	2-呋喃基	
12.16	4-Cl(Ph)	H	2-呋喃基	
12.17	2-F(Ph)	H	2-呋喃基	
12.18	3-F(Ph)	H	2-呋喃基	
12.19	4-F(Ph)	H	2-呋喃基	
12.20	2-CF ₃ (Ph)	H	2-呋喃基	
12.21	3-CF ₃ (Ph)	H	2-呋喃基	

五、發明說明 (62)

表 12 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
12.22	4-CF ₃ (Ph)	H	2-呋喃基	
12.23	2,4-Cl(Ph)	H	2-呋喃基	
12.24	2,4-F(Ph)	H	2-呋喃基	
12.25	H	H	3-呋喃基	
12.26	CH ₃	H	3-呋喃基	
12.27	C ₂ H ₅	H	3-呋喃基	
12.28	n-C ₃ H ₇	H	3-呋喃基	
12.29	iso-C ₃ H ₇	H	3-呋喃基	
12.30	n-C ₄ H ₉	H	3-呋喃基	
12.31	iso-C ₄ H ₉	H	3-呋喃基	
12.32	c-C ₃ H ₅	H	3-呋喃基	
12.33	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	3-呋喃基	
12.34	C(H)=N-OCH ₃	H	3-呋喃基	
12.35	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	3-呋喃基	
12.36	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	3-呋喃基	
12.37	Ph	H	3-呋喃基	
12.38	2-Cl(Ph)	H	3-呋喃基	
12.39	3-Cl(Ph)	H	3-呋喃基	
12.40	4-Cl(Ph)	H	3-呋喃基	
12.41	2-F(Ph)	H	3-呋喃基	
12.42	3-F(Ph)	H	3-呋喃基	
12.43	4-F(Ph)	H	3-呋喃基	
12.44	2-CF ₃ (Ph)	H	3-呋喃基	
12.45	3-CF ₃ (Ph)	H	3-呋喃基	
12.46	4-CF ₃ (Ph)	H	3-呋喃基	
12.47	2,4-Cl(Ph)	H	3-呋喃基	
12.48	2,4-F(Ph)	H	3-呋喃基	
12.49	H	H	2-噻吩基	
12.50	CH ₃	H	2-噻吩基	
12.50A	CH ₃	H	2-噻吩基	油狀物，異構物A
12.50B	CH ₃	H	2-噻吩基	油狀物，異構物B
12.51	C ₂ H ₅	H	2-噻吩基	
12.52	n-C ₃ H ₇	H	2-噻吩基	
12.53	iso-C ₃ H ₇	H	2-噻吩基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

總

五、發明說明 (63)

表 12 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
12.54	n-C ₄ H ₉	H	2-噻吩基	
12.55	iso-C ₄ H ₉	H	2-噻吩基	
12.56	c-C ₃ H ₅	H	2-噻吩基	
12.57	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2-噻吩基	
12.58	C(H)=N-OCH ₃	H	2-噻吩基	
12.59	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2-噻吩基	
12.60	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2-噻吩基	
12.61	Ph	H	2-噻吩基	
12.62	2-Cl(Ph)	H	2-噻吩基	
12.63	3-Cl(Ph)	H	2-噻吩基	
12.64	4-Cl(Ph)	H	2-噻吩基	
12.65	2-F(Ph)	H	2-噻吩基	
12.66	3-F(Ph)	H	2-噻吩基	
12.67	4-F(Ph)	H	2-噻吩基	
12.68	2-CF ₃ (Ph)	H	2-噻吩基	
12.69	3-CF ₃ (Ph)	H	2-噻吩基	
12.70	4-CF ₃ (Ph)	H	2-噻吩基	
12.71	2,4-Cl(Ph)	H	2-噻吩基	
12.72	2,4-F(Ph)	H	2-噻吩基	
12.73	H	H	3-噻吩基	
12.74	CH ₃	H	3-噻吩基	
12.75	C ₂ H ₅	H	3-噻吩基	
12.76	n-C ₃ H ₇	H	3-噻吩基	
12.77	iso-C ₃ H ₇	H	3-噻吩基	
12.78	n-C ₄ H ₉	H	3-噻吩基	
12.79	iso-C ₄ H ₉	H	3-噻吩基	
12.80	c-C ₃ H ₅	H	3-噻吩基	
12.81	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	3-噻吩基	
12.82	C(H)=N-OCH ₃	H	3-噻吩基	
12.83	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	3-噻吩基	
12.84	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	3-噻吩基	
12.85	Ph	H	3-噻吩基	

五、發明說明 (64)

表 12 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
12.86	2-Cl(Ph)	H	3-噻吩基	
12.87	3-Cl(Ph)	H	3-噻吩基	
12.88	4-Cl(Ph)	H	3-噻吩基	
12.89	2-F(Ph)	H	3-噻吩基	
12.90	3-F(Ph)	H	3-噻吩基	
12.91	4-F(Ph)	H	3-噻吩基	
12.92	2-CF ₃ (Ph)	H	3-噻吩基	
12.93	3-CF ₃ (Ph)	H	3-噻吩基	
12.94	4-CF ₃ (Ph)	H	3-噻吩基	
12.95	2,4-Cl(Ph)	H	3-噻吩基	
12.96	2,4-F(Ph)	H	3-噻吩基	
12.97	H	H	2-吡啶基	
12.98A	CH ₃	H	2-吡啶基	油狀物，異構物A
12.98B	CH ₃	H	2-吡啶基	油狀物，異構物B
12.99	C ₂ H ₅	H	2-吡啶基	
12.100	n-C ₃ H ₇	H	2-吡啶基	
12.101	iso-C ₃ H ₇	H	2-吡啶基	
12.102	n-C ₄ H ₉	H	2-吡啶基	
12.103	iso-C ₄ H ₉	H	2-吡啶基	
12.104	c-C ₃ H ₅	H	2-吡啶基	
12.105	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	2-吡啶基	
12.106	C(H)=N-OCH ₃	H	2-吡啶基	
12.107	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	2-吡啶基	
12.108	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	2-吡啶基	
12.109	Ph	H	2-吡啶基	
12.110	2-Cl(Ph)	H	2-吡啶基	
12.111	3-Cl(Ph)	H	2-吡啶基	
12.112	4-Cl(Ph)	H	2-吡啶基	
12.113	2-F(Ph)	H	2-吡啶基	
12.114	3-F(Ph)	H	2-吡啶基	
12.115	4-F(Ph)	H	2-吡啶基	
12.116	2-CF ₃ (Ph)	H	2-吡啶基	
12.117	3-CF ₃ (Ph)	H	2-吡啶基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

總

五、發明說明 (65)

表 12 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
12.118	4-CF ₃ (Ph)	H	2-吡啶基	
12.119	2,4-Cl(Ph)	H	2-吡啶基	
12.120	2,4-F(Ph)	H	2-吡啶基	
12.121	H	H	3-吡啶基	
12.122A	CH ₃	H	3-吡啶基	油狀物，異構物A
12.122B	CH ₃	H	3-吡啶基	油狀物，異構物B
12.123	C ₂ H ₅	H	3-吡啶基	
12.124	n-C ₃ H ₇	H	3-吡啶基	
12.125	iso-C ₃ H ₇	H	3-吡啶基	
12.126	n-C ₄ H ₉	H	3-吡啶基	
12.127	iso-C ₄ H ₉	H	3-吡啶基	
12.128	c-C ₃ H ₅	H	3-吡啶基	
12.129	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	3-吡啶基	
12.130	C(H)=N-OCH ₃	H	3-吡啶基	
12.131	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	3-吡啶基	
12.132	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	3-吡啶基	
12.133	Ph	H	3-吡啶基	
12.134	2-Cl(Ph)	H	3-吡啶基	
12.135	3-Cl(Ph)	H	3-吡啶基	
12.136	4-Cl(Ph)	H	3-吡啶基	
12.137	2-F(Ph)	H	3-吡啶基	
12.138	3-F(Ph)	H	3-吡啶基	
12.139	4-F(Ph)	H	3-吡啶基	
12.140	2-CF ₃ (Ph)	H	3-吡啶基	
12.141	3-CF ₃ (Ph)	H	3-吡啶基	
12.142	4-CF ₃ (Ph)	H	3-吡啶基	
12.143	2,4-Cl(Ph)	H	3-吡啶基	
12.144	2,4-F(Ph)	H	3-吡啶基	
12.145	H	H	4-吡啶基	
12.146	CH ₃	H	4-吡啶基	
12.147	C ₂ H ₅	H	4-吡啶基	
12.148	n-C ₃ H ₇	H	4-吡啶基	
12.149	iso-C ₃ H ₇	H	4-吡啶基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

編

五、發明說明 (66)

表 1 2 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
12.150	n-C ₄ H ₉	H	4-吡啶基	
12.151	iso-C ₄ H ₉	H	4-吡啶基	
12.152	c-C ₃ H ₅	H	4-吡啶基	
12.153	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	H	4-吡啶基	
12.154	C(H)=N-OCH ₃	H	4-吡啶基	
12.155	C(CH ₃)=N-OCH ₃	H	4-吡啶基	
12.156	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	H	4-吡啶基	
12.157	Ph	H	4-吡啶基	
12.158	2-Cl(Ph)	H	4-吡啶基	
12.159	3-Cl(Ph)	H	4-吡啶基	
12.160	4-Cl(Ph)	H	4-吡啶基	
12.161	2-F(Ph)	H	4-吡啶基	
12.162	3-F(Ph)	H	4-吡啶基	
12.163	4-F(Ph)	H	4-吡啶基	
12.164	2-CF ₃ (Ph)	H	4-吡啶基	
12.165	3-CF ₃ (Ph)	H	4-吡啶基	
12.166	4-CF ₃ (Ph)	H	4-吡啶基	
12.167	2,4-Cl(Ph)	H	4-吡啶基	
12.168	2,4-F(Ph)	H	4-吡啶基	
12.169	H	H	吡嗪基	
12.170	CH ₃	H	吡嗪基	
12.171	C ₂ H ₅	H	吡嗪基	
12.172	n-C ₃ H ₇	H	吡嗪基	
12.173	iso-C ₃ H ₇	H	吡嗪基	
12.174	n-C ₄ H ₉	H	吡嗪基	
12.175	iso-C ₄ H ₉	H	吡嗪基	
12.176	c-C ₃ H ₅	H	吡嗪基	
12.177	H	H	喹啉-4-基	
12.178	CH ₃	H	喹啉-4-基	
12.179	C ₂ H ₅	H	喹啉-4-基	
12.180	n-C ₃ H ₇	H	喹啉-4-基	
12.181	iso-C ₃ H ₇	H	喹啉-4-基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (67)

表 12 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
12.182	n-C ₄ H ₉	H	喹啉-4-基	
12.183	iso-C ₄ H ₉	H	喹啉-4-基	
12.184	c-C ₃ H ₅	H	喹啉-4-基	
12.185	H	CH ₃	2-呋喃基	
12.186	CH ₃	CH ₃	2-呋喃基	
12.187	C ₂ H ₅	CH ₃	2-呋喃基	
12.188	n-C ₃ H ₇	CH ₃	2-呋喃基	
12.189	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	2-呋喃基	
12.190	n-C ₄ H ₉	CH ₃	2-呋喃基	
12.191	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	2-呋喃基	
12.192	c-C ₃ H ₅	CH ₃	2-呋喃基	
12.193	H	CH ₃	3-呋喃基	
12.194	CH ₃	CH ₃	3-呋喃基	
12.195	C ₂ H ₅	CH ₃	3-呋喃基	
12.196	n-C ₃ H ₇	CH ₃	3-呋喃基	
12.197	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	3-呋喃基	
12.198	n-C ₄ H ₉	CH ₃	3-呋喃基	
12.199	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	3-呋喃基	
12.200	c-C ₃ H ₅	CH ₃	3-呋喃基	
12.201	H	CH ₃	2-噻吩基	
12.202	CH ₃	CH ₃	2-噻吩基	
12.203	C ₂ H ₅	CH ₃	2-噻吩基	
12.204	n-C ₃ H ₇	CH ₃	2-噻吩基	
12.205	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	2-噻吩基	
12.206	n-C ₄ H ₉	CH ₃	2-噻吩基	
12.207	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	2-噻吩基	
12.208	c-C ₃ H ₅	CH ₃	2-噻吩基	
12.209	H	CH ₃	3-噻吩基	
12.210	CH ₃	CH ₃	3-噻吩基	
12.211	C ₂ H ₅	CH ₃	3-噻吩基	
12.212	n-C ₃ H ₇	CH ₃	3-噻吩基	
12.213	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	3-噻吩基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

約

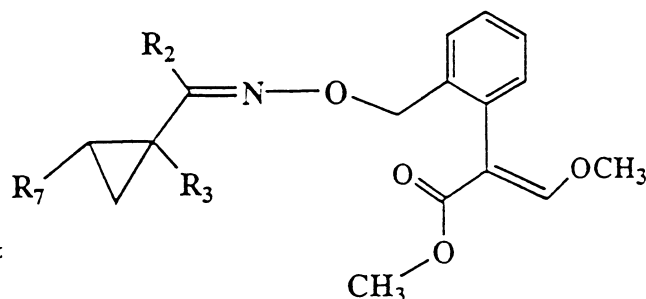
五、發明說明 (68)

表 12 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
12.214	n-C ₄ H ₉	CH ₃	3-噻吩基	
12.215	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	3-噻吩基	
12.216	c-C ₃ H ₅	CH ₃	3-噻吩基	
12.217	H	CH ₃	2-吡啶基	
12.218	CH ₃	CH ₃	2-吡啶基	
12.219	C ₂ H ₅	CH ₃	2-吡啶基	
12.220	n-C ₃ H ₇	CH ₃	2-吡啶基	
12.221	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	2-吡啶基	
12.222	n-C ₄ H ₉	CH ₃	2-吡啶基	
12.223	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	2-吡啶基	
12.224	c-C ₃ H ₅	CH ₃	2-吡啶基	
12.225	H	CH ₃	3-吡啶基	
12.226	CH ₃	CH ₃	3-吡啶基	
12.227	C ₂ H ₅	CH ₃	3-吡啶基	
12.228	n-C ₃ H ₇	CH ₃	3-吡啶基	
12.229	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	3-吡啶基	
12.230	n-C ₄ H ₉	CH ₃	3-吡啶基	
12.231	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	3-吡啶基	
12.232	c-C ₃ H ₅	CH ₃	3-吡啶基	
12.233	H	CH ₃	4-吡啶基	
12.234	CH ₃	CH ₃	4-吡啶基	
12.235	C ₂ H ₅	CH ₃	4-吡啶基	
12.236	n-C ₃ H ₇	CH ₃	4-吡啶基	
12.237	iso-C ₃ H ₇	CH ₃	4-吡啶基	
12.238	n-C ₄ H ₉	CH ₃	4-吡啶基	
12.239	iso-C ₄ H ₉	CH ₃	4-吡啶基	
12.240	c-C ₃ H ₅	CH ₃	4-吡啶基	

典型的包括本發明之式 I (其中 $\overline{A}=R_4=R_5=R_6=H$) 化合物如表 13 之式 IV ($X=CH$ 且 Z 是 O) 所示, 其中 R_2 , R_3 及 R_7 如表 13 所定義。

五、發明說明 (69)



式 IV

表 13

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
13.1	H	Ph	2-呋喃基	
13.2	H	Ph	3-呋喃基	
13.3	H	Ph	2-噻吩基	
13.4	H	Ph	3-噻吩基	
13.5	H	Ph	2-吡啶基	
13.6	H	Ph	3-吡啶基	
13.7	H	Ph	4-吡啶基	
13.8	H	Ph	吡嗪基	
13.9	H	Ph	嘧啶-2-基	
13.10	H	Ph	嘧啶-4-基	
13.11	H	Ph	嘧啶-5-基	
13.12	H	Ph	喹啉-2-基	
13.13	H	Ph	喹啉-3-基	
13.14	H	Ph	喹啉-4-基	
13.15	CH ₃	Ph	2-呋喃基	
13.16	CH ₃	Ph	3-呋喃基	
13.17	CH ₃	Ph	2-噻吩基	
13.18	CH ₃	Ph	3-噻吩基	
13.19	CH ₃	Ph	2-吡啶基	
13.20	CH ₃	Ph	3-吡啶基	
13.21	CH ₃	Ph	4-吡啶基	

五、發明說明 (70)

表 13 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
13.22	CH ₃	Ph	吡咩基	
13.23	CH ₃	Ph	嘧啶-2-基	
13.24	CH ₃	Ph	嘧啶-4-基	
13.25	CH ₃	Ph	嘧啶-5-基	
13.26	CH ₃	Ph	喹啉-2-基	
13.27	CH ₃	Ph	喹啉-3-基	
13.28	CH ₃	Ph	喹啉-4-基	
13.29	C ₂ H ₅	Ph	2-呋喃基	
13.30	C ₂ H ₅	Ph	3-呋喃基	
13.31	C ₂ H ₅	Ph	2-噻吩基	
13.32	C ₂ H ₅	Ph	3-噻吩基	
13.33	C ₂ H ₅	Ph	2-吡啶基	
13.34	C ₂ H ₅	Ph	3-吡啶基	
13.35	C ₂ H ₅	Ph	4-吡啶基	
13.36	C ₂ H ₅	Ph	吡咩基	
13.37	C ₂ H ₅	Ph	嘧啶-2-基	
13.38	C ₂ H ₅	Ph	嘧啶-4-基	
13.39	C ₂ H ₅	Ph	嘧啶-5-基	
13.40	C ₂ H ₅	Ph	喹啉-2-基	
13.41	C ₂ H ₅	Ph	喹啉-3-基	
13.42	C ₂ H ₅	Ph	喹啉-4-基	
13.43	n-C ₃ H ₇	Ph	2-呋喃基	
13.44	n-C ₃ H ₇	Ph	3-呋喃基	
13.45	n-C ₃ H ₇	Ph	2-噻吩基	
13.46	n-C ₃ H ₇	Ph	3-噻吩基	
13.47	n-C ₃ H ₇	Ph	2-吡啶基	
13.48	n-C ₃ H ₇	Ph	3-吡啶基	
13.49	n-C ₃ H ₇	Ph	4-吡啶基	
13.50	n-C ₃ H ₇	Ph	吡咩基	
13.51	n-C ₃ H ₇	Ph	嘧啶-2-基	
13.52	n-C ₃ H ₇	Ph	嘧啶-4-基	
13.53	n-C ₃ H ₇	Ph	嘧啶-5-基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

裝

五、發明說明 (71)

表 13 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
13.54	n-C ₃ H ₇	Ph	喹啉-2-基	
13.55	n-C ₃ H ₇	Ph	喹啉-3-基	
13.56	n-C ₃ H ₇	Ph	喹啉-4-基	
13.57	iso-C ₃ H ₇	Ph	2-吡啶基	
13.58	n-C ₄ H ₉	Ph	2-吡啶基	
13.59	iso-C ₄ H ₉	Ph	2-吡啶基	
13.60	c-C ₃ H ₅	Ph	2-吡啶基	
13.61	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	Ph	2-吡啶基	
13.62	C(H)=N-OCH ₃	Ph	2-吡啶基	
13.63	C(CH ₃)=N-OCH ₃	Ph	2-吡啶基	
13.64	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	Ph	2-吡啶基	
13.65	Ph	Ph	2-吡啶基	
13.66	Ph	Ph	2-吡啶基	
13.67	Ph	Ph	2-吡啶基	
13.68	Ph	Ph	2-吡啶基	
13.69	4-Cl(Ph)	Ph	2-吡啶基	
13.70	4-Cl(Ph)	Ph	2-吡啶基	
13.71	4-F(Ph)	Ph	2-吡啶基	
13.72	4-F(Ph)	Ph	2-吡啶基	
13.73	4-CF ₃ (Ph)	Ph	2-吡啶基	
13.74	4-CF ₃ (Ph)	Ph	2-吡啶基	
13.75	2,4-Cl(Ph)	Ph	2-吡啶基	
13.76	2,4-Cl(Ph)	Ph	2-吡啶基	
13.77	2,4-F(Ph)	Ph	2-吡啶基	
13.78	C ₂ H ₅	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.79	n-C ₃ H ₇	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.80	iso-C ₃ H ₇	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.81	n-C ₄ H ₉	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.82	iso-C ₄ H ₉	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.83	c-C ₃ H ₅	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.84	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.85	C(H)=N-OCH ₃	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

約

五、發明說明 (72)

表 13 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
13.86	C(CH ₃)=N-OCH ₃	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.87	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.88	Ph	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.89	Ph	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.90	Ph	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.91	Ph	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.92	4-Cl(Ph)	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.93	4-Cl(Ph)	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.94	4-F(Ph)	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.95	4-F(Ph)	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.96	4-CF ₃ (Ph)	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.97	4-CF ₃ (Ph)	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.98	2,4-Cl(Ph)	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.99	2,4-Cl(Ph)	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.100	2,4-F(Ph)	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	
13.101	H	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.102	CH ₃	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.103	C ₂ H ₅	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.104	n-C ₃ H ₇	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.105	iso-C ₃ H ₇	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.106	n-C ₄ H ₉	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.107	iso-C ₄ H ₉	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.108	c-C ₃ H ₅	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.109	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.110	C(H)=N-OCH ₃	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.111	C(CH ₃)=N-OCH ₃	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.112	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.113	Ph	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.114	2-Cl(Ph)	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.115	3-Cl(Ph)	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.116	4-Cl(Ph)	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.117	2-F(Ph)	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (73)

表 13 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
13.118	3-F(Ph)	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.119	4-F(Ph)	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.120	2-CF ₃ (Ph)	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.121	3-CF ₃ (Ph)	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.122	4-CF ₃ (Ph)	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.123	2,4-Cl(Ph)	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.124	2,4-F(Ph)	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	
13.125	H	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.126	CH ₃	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.127	C ₂ H ₅	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.128	n-C ₃ H ₇	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.129	iso-C ₃ H ₇	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.130	n-C ₄ H ₉	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.131	iso-C ₄ H ₉	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.132	c-C ₃ H ₅	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.133	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.134	C(H)=N-OCH ₃	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.135	C(CH ₃)=N-OCH ₃	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.136	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.137	Ph	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.138	2-Cl(Ph)	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.139	3-Cl(Ph)	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.140	4-Cl(Ph)	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.141	2-F(Ph)	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.142	3-F(Ph)	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.143	4-F(Ph)	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	
13.144	2-CF ₃ (Ph)	4-Cl(Ph)	4-吡啶基	
13.145	3-CF ₃ (Ph)	4-Cl(Ph)	4-吡啶基	
13.146	4-CF ₃ (Ph)	4-Cl(Ph)	4-吡啶基	
13.147	2,4-Cl(Ph)	4-Cl(Ph)	4-吡啶基	
13.148	2,4-F(Ph)	4-Cl(Ph)	4-吡啶基	
13.149	H	1-萘基	2-噻吩基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (74)

表 13 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
13.150	CH ₃	1-萘基	2-噻吩基	
13.151	C ₂ H ₅	1-萘基	2-噻吩基	
13.152	n-C ₃ H ₇	1-萘基	2-噻吩基	
13.153	iso-C ₃ H ₇	1-萘基	2-噻吩基	
13.154	n-C ₄ H ₉	1-萘基	2-噻吩基	
13.155	iso-C ₄ H ₉	1-萘基	2-噻吩基	
13.156	c-C ₃ H ₅	1-萘基	2-噻吩基	
13.157	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	1-萘基	2-噻吩基	
13.158	C(H)=N-OCH ₃	1-萘基	2-噻吩基	
13.159	C(CH ₃)=N-OCH ₃	1-萘基	2-噻吩基	
13.160	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	1-萘基	2-噻吩基	
13.161	Ph	1-萘基	2-噻吩基	
13.162	2-Cl(Ph)	1-萘基	2-噻吩基	
13.163	3-Cl(Ph)	1-萘基	2-噻吩基	
13.164	4-Cl(Ph)	1-萘基	2-噻吩基	
13.165	2-F(Ph)	1-萘基	2-噻吩基	
13.166	3-F(Ph)	1-萘基	2-噻吩基	
13.167	4-F(Ph)	1-萘基	2-噻吩基	
13.168	2-CF ₃ (Ph)	1-萘基	2-噻吩基	
13.169	3-CF ₃ (Ph)	1-萘基	2-噻吩基	
13.170	4-CF ₃ (Ph)	1-萘基	2-噻吩基	
13.171	2,4-Cl(Ph)	1-萘基	2-噻吩基	
13.172	2,4-F(Ph)	1-萘基	2-噻吩基	
13.173	H	2-萘基	3-噻吩基	
13.174	CH ₃	2-萘基	3-噻吩基	
13.175	C ₂ H ₅	2-萘基	3-噻吩基	
13.176	n-C ₃ H ₇	2-萘基	3-噻吩基	
13.177	iso-C ₃ H ₇	2-萘基	3-噻吩基	
13.178	n-C ₄ H ₉	2-萘基	3-噻吩基	
13.179	iso-C ₄ H ₉	2-萘基	3-噻吩基	
13.180	c-C ₃ H ₅	2-萘基	3-噻吩基	
13.181	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	2-萘基	3-噻吩基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (75)

表 13 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
13.182	$C(H)=N-OCH_3$	2-萘基	3-噻吩基	
13.183	$C(CH_3)=N-OCH_3$	2-萘基	3-噻吩基	
13.184	$C(C_2H_5)=N-OCH_3$	2-萘基	3-噻吩基	
13.185	Ph	2-萘基	3-噻吩基	
13.186	2-Cl(Ph)	2-萘基	3-噻吩基	
13.187	3-Cl(Ph)	2-萘基	3-噻吩基	
13.188	4-Cl(Ph)	2-萘基	3-噻吩基	
13.189	2-F(Ph)	2-萘基	3-噻吩基	
13.190	3-F(Ph)	2-萘基	3-噻吩基	
13.191	4-F(Ph)	2-萘基	3-噻吩基	
13.192	2-CF ₃ (Ph)	2-萘基	3-噻吩基	
13.193	3-CF ₃ (Ph)	2-萘基	3-噻吩基	
13.194	4-CF ₃ (Ph)	2-萘基	3-噻吩基	
13.195	2,4-Cl(Ph)	2-萘基	3-噻吩基	
13.196	2,4-F(Ph)	2-萘基	3-噻吩基	

表 14 :

化合物 14.1 至 14.196 是式 V 化合物 ($X=N$ 且 $Z=O$)，其中取代基 R_2 ， R_3 及 R_7 如表 13 所定義。

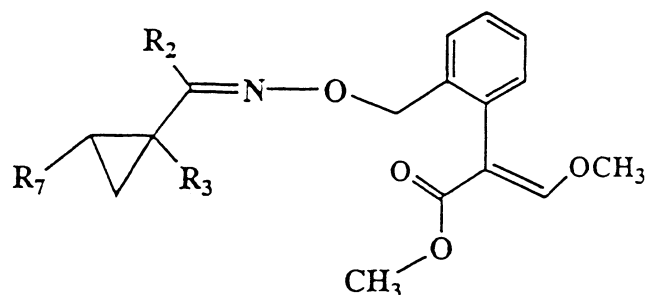
表 15 :

化合物 15.1 至 15.196 是式 VII 化合物 ($X=N$ 且 $Z=NH$)，其中取代基 R_2 ， R_3 及 R_7 如表 13 所定義。

典型的包括本發明之式 I (其中 $A=R_4=R_5=R_6=H$) 化合物包括如表 16 之式 IV ($X=CH$ 且 Z 是 O) 所示，其中 R_2 ， R_3 及 R_7 如表 16 所定義。

—

五、發明說明 (76)



式 IV

表 16

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
16.1	H	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.2	CH ₃	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.3	C ₂ H ₅	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.4	n-C ₃ H ₇	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.5	iso-C ₃ H ₇	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.6	n-C ₄ H ₉	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.7	iso-C ₄ H ₉	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.8	c-C ₃ H ₅	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.9	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.10	C(H)=N-OCH ₃	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.11	C(CH ₃)=N-OCH ₃	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.12	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.13	Ph	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.14	2-Cl(Ph)	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.15	3-Cl(Ph)	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.16	4-Cl(Ph)	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.17	2-F(Ph)	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.18	3-F(Ph)	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.19	4-F(Ph)	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.20	2-CF ₃ (Ph)	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.21	3-CF ₃ (Ph)	2-呋喃基	2-呋喃基	

五、發明說明 (77)

表 16 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
16.22	4-CF ₃ (Ph)	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.23	2,4-Cl(Ph)	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.24	2,4-F(Ph)	2-呋喃基	2-呋喃基	
16.25	H	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.26	CH ₃	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.27	C ₂ H ₅	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.28	n-C ₃ H ₇	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.29	iso-C ₃ H ₇	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.30	n-C ₄ H ₉	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.31	iso-C ₄ H ₉	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.32	c-C ₃ H ₅	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.33	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.34	C(H)=N-OCH ₃	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.35	C(CH ₃)=N-OCH ₃	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.36	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.37	Ph	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.38	2-Cl(Ph)	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.39	3-Cl(Ph)	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.40	4-Cl(Ph)	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.41	2-F(Ph)	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.42	3-F(Ph)	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.43	4-F(Ph)	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.44	2-CF ₃ (Ph)	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.45	3-CF ₃ (Ph)	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.46	4-CF ₃ (Ph)	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.47	2,4-Cl(Ph)	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.48	2,4-F(Ph)	3-呋喃基	2-呋喃基	
16.49	H	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.50	CH ₃	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.51	C ₂ H ₅	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.52	n-C ₃ H ₇	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.53	iso-C ₃ H ₇	2-噻吩基	2-呋喃基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (78)

表 16 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
16.54	n-C ₄ H ₉	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.55	iso-C ₄ H ₉	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.56	c-C ₃ H ₅	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.57	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.58	C(H)=N-OCH ₃	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.59	C(CH ₃)=N-OCH ₃	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.60	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.61	Ph	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.62	2-Cl(Ph)	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.63	3-Cl(Ph)	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.64	4-Cl(Ph)	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.65	2-F(Ph)	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.66	3-F(Ph)	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.67	4-F(Ph)	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.68	2-CF ₃ (Ph)	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.69	3-CF ₃ (Ph)	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.70	4-CF ₃ (Ph)	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.71	2,4-Cl(Ph)	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.72	2,4-F(Ph)	2-噻吩基	2-呋喃基	
16.73	H	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.74	CH ₃	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.75	C ₂ H ₅	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.76	n-C ₃ H ₇	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.77	iso-C ₃ H ₇	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.78	n-C ₄ H ₉	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.79	iso-C ₄ H ₉	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.80	c-C ₃ H ₅	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.81	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.82	C(H)=N-OCH ₃	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.83	C(CH ₃)=N-OCH ₃	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.84	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.85	Ph	3-噻吩基	2-呋喃基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

編

五、發明說明 (79)

表 16 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
16.86	2-Cl(Ph)	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.87	3-Cl(Ph)	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.88	4-Cl(Ph)	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.89	2-F(Ph)	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.90	3-F(Ph)	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.91	4-F(Ph)	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.92	2-CF ₃ (Ph)	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.93	3-CF ₃ (Ph)	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.94	4-CF ₃ (Ph)	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.95	2,4-Cl(Ph)	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.96	2,4-F(Ph)	3-噻吩基	2-呋喃基	
16.97	H	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.98	CH ₃	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.99	C ₂ H ₅	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.100	n-C ₃ H ₇	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.101	iso-C ₃ H ₇	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.102	n-C ₄ H ₉	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.103	iso-C ₄ H ₉	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.104	c-C ₃ H ₅	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.105	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.106	C(H)=N-OCH ₃	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.107	C(CH ₃)=N-OCH ₃	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.108	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.109	Ph	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.110	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.111	3-Cl(Ph)	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.112	4-Cl(Ph)	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.113	2-F(Ph)	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.114	3-F(Ph)	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.115	4-F(Ph)	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.116	2-CF ₃ (Ph)	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.117	3-CF ₃ (Ph)	2-吡啶基	2-呋喃基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

約

五、發明說明 (80)

表 16 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
16.118	4-CF ₃ (Ph)	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.119	2,4-Cl(Ph)	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.120	2,4-F(Ph)	2-吡啶基	2-呋喃基	
16.121	H	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.122	CH ₃	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.123	C ₂ H ₅	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.124	n-C ₃ H ₇	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.125	iso-C ₃ H ₇	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.126	n-C ₄ H ₉	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.127	iso-C ₄ H ₉	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.128	c-C ₃ H ₅	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.129	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.130	C(H)=N-OCH ₃	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.131	C(CH ₃)=N-OCH ₃	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.132	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.133	Ph	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.134	2-Cl(Ph)	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.135	3-Cl(Ph)	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.136	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.137	2-F(Ph)	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.138	3-F(Ph)	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.139	4-F(Ph)	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.140	2-CF ₃ (Ph)	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.141	3-CF ₃ (Ph)	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.142	4-CF ₃ (Ph)	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.143	2,4-Cl(Ph)	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.144	2,4-F(Ph)	3-吡啶基	2-呋喃基	
16.145	H	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.146	CH ₃	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.147	C ₂ H ₅	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.148	n-C ₃ H ₇	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.149	iso-C ₃ H ₇	4-吡啶基	2-呋喃基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (81)

表 16 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
16.150	n-C ₄ H ₉	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.151	iso-C ₄ H ₉	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.152	c-C ₃ H ₅	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.153	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.154	C(H)=N-OCH ₃	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.155	C(CH ₃)=N-OCH ₃	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.156	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.157	Ph	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.158	2-Cl(Ph)	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.159	3-Cl(Ph)	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.160	4-Cl(Ph)	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.161	2-F(Ph)	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.162	3-F(Ph)	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.163	4-F(Ph)	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.164	2-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.165	3-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.166	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.167	2,4-Cl(Ph)	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.168	2,4-F(Ph)	4-吡啶基	2-呋喃基	
16.169	H	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.170	CH ₃	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.171	C ₂ H ₅	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.172	n-C ₃ H ₇	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.173	iso-C ₃ H ₇	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.174	n-C ₄ H ₉	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.175	iso-C ₄ H ₉	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.176	c-C ₃ H ₅	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.177	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.178	C(H)=N-OCH ₃	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.179	C(CH ₃)=N-OCH ₃	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.180	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.181	Ph	2-呋喃基	2-吡啶基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (82)

表 16 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
16.182	2-Cl(Ph)	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.183	3-Cl(Ph)	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.184	4-Cl(Ph)	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.185	2-F(Ph)	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.186	3-F(Ph)	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.187	4-F(Ph)	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.188	2-CF ₃ (Ph)	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.189	3-CF ₃ (Ph)	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.190	4-CF ₃ (Ph)	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.191	2,4-Cl(Ph)	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.192	2,4-F(Ph)	2-呋喃基	2-吡啶基	
16.193	H	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.194	CH ₃	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.195	C ₂ H ₅	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.196	n-C ₃ H ₇	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.197	iso-C ₃ H ₇	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.198	n-C ₄ H ₉	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.199	iso-C ₄ H ₉	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.200	c-C ₃ H ₅	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.201	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.202	C(H)=N-OCH ₃	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.203	C(CH ₃)=N-OCH ₃	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.204	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.205	Ph	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.206	2-Cl(Ph)	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.207	3-Cl(Ph)	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.208	4-Cl(Ph)	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.209	2-F(Ph)	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.210	3-F(Ph)	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.211	4-F(Ph)	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.212	2-CF ₃ (Ph)	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.213	3-CF ₃ (Ph)	3-呋喃基	2-吡啶基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

編

五、發明說明 (83)

表 16 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
16.214	4-CF ₃ (Ph)	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.215	2,4-Cl(Ph)	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.216	2,4-F(Ph)	3-呋喃基	2-吡啶基	
16.217	H	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.218	CH ₃	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.219	C ₂ H ₅	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.220	n-C ₃ H ₇	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.221	iso-C ₃ H ₇	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.222	n-C ₄ H ₉	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.223	iso-C ₄ H ₉	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.224	c-C ₃ H ₅	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.225	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.226	C(H)=N-OCH ₃	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.227	C(CH ₃)=N-OCH ₃	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.228	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.229	Ph	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.230	2-Cl(Ph)	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.231	3-Cl(Ph)	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.232	4-Cl(Ph)	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.233	2-F(Ph)	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.234	3-F(Ph)	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.235	4-F(Ph)	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.236	2-CF ₃ (Ph)	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.237	3-CF ₃ (Ph)	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.238	4-CF ₃ (Ph)	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.239	2,4-Cl(Ph)	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.240	2,4-F(Ph)	2-噻吩基	2-吡啶基	
16.241	H	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.242	CH ₃	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.243	C ₂ H ₅	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.244	n-C ₃ H ₇	3-噻吩基	2-吡啶基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (84)

表 16 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
16.245	iso-C ₃ H ₇	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.246	n-C ₄ H ₉	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.247	iso-C ₄ H ₉	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.248	c-C ₃ H ₅	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.249	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.250	C(H)=N-OCH ₃	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.251	C(CH ₃)=N-OCH ₃	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.252	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.253	Ph	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.254	2-Cl(Ph)	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.255	3-Cl(Ph)	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.256	4-Cl(Ph)	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.257	2-F(Ph)	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.258	3-F(Ph)	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.259	4-F(Ph)	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.260	2-CF ₃ (Ph)	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.261	3-CF ₃ (Ph)	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.262	4-CF ₃ (Ph)	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.263	2,4-Cl(Ph)	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.264	2,4-F(Ph)	3-噻吩基	2-吡啶基	
16.265	H	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.266	CH ₃	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.267	C ₂ H ₅	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.268	n-C ₃ H ₇	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.269	iso-C ₃ H ₇	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.270	n-C ₄ H ₉	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.271	iso-C ₄ H ₉	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.272	c-C ₃ H ₅	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.273	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	2-吡啶基	2-吡啶基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (85)

表 16 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
16.274	C(H)=N-OCH ₃	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.275	C(CH ₃)=N-OCH ₃	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.276	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.277	Ph	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.278	2-Cl(Ph)	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.279	3-Cl(Ph)	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.280	4-Cl(Ph)	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.281	2-F(Ph)	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.282	3-F(Ph)	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.283	4-F(Ph)	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.284	2-CF ₃ (Ph)	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.285	3-CF ₃ (Ph)	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.286	4-CF ₃ (Ph)	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.287	2,4-Cl(Ph)	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.288	2,4-F(Ph)	2-吡啶基	2-吡啶基	
16.289	H	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.290	CH ₃	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.291	C ₂ H ₅	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.292	n-C ₃ H ₇	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.293	iso-C ₃ H ₇	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.294	n-C ₄ H ₉	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.295	iso-C ₄ H ₉	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.296	c-C ₃ H ₅	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.297	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.298	C(H)=N-OCH ₃	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.299	C(CH ₃)=N-OCH ₃	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.300	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.301	Ph	3-吡啶基	2-吡啶基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝 · 訂

五、發明說明 (86)

表 16 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
16.302	2-Cl(Ph)	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.303	3-Cl(Ph)	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.304	4-Cl(Ph)	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.305	2-F(Ph)	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.306	3-F(Ph)	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.307	4-F(Ph)	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.308	2-CF ₃ (Ph)	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.309	3-CF ₃ (Ph)	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.310	4-CF ₃ (Ph)	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.311	2,4-Cl(Ph)	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.312	2,4-F(Ph)	3-吡啶基	2-吡啶基	
16.313	H	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.314	CH ₃	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.315	C ₂ H ₅	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.316	n-C ₃ H ₇	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.317	iso-C ₃ H ₇	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.318	n-C ₄ H ₉	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.319	iso-C ₄ H ₉	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.320	c-C ₃ H ₅	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.321	1-CH ₃ -c-C ₃ H ₅	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.322	C(H)=N-OCH ₃	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.323	C(CH ₃)=N-OCH ₃	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.324	C(C ₂ H ₅)=N-OCH ₃	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.325	Ph	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.326	2-Cl(Ph)	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.327	3-Cl(Ph)	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.328	4-Cl(Ph)	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.329	2-F(Ph)	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.330	3-F(Ph)	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.331	4-F(Ph)	4-吡啶基	2-吡啶基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (87)

表 16 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
16.332	2-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.333	3-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.334	4-CF ₃ (Ph)	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.335	2,4-Cl(Ph)	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.336	2,4-F(Ph)	4-吡啶基	2-吡啶基	
16.337	CH ₃	2-噻吩基	3-吡啶基	
16.338	CH ₃	3-噻吩基	3-吡啶基	
16.339	CH ₃	2-吡啶基	3-吡啶基	
16.340	CH ₃	3-吡啶基	3-吡啶基	
16.341	CH ₃	4-吡啶基	3-吡啶基	
16.342	CH ₃	吡嗪基	3-吡啶基	
16.343	CH ₃	喹啉-2-基	3-吡啶基	
16.344	CH ₃	喹啉-4-基	3-吡啶基	
16.345	CH ₃	嘧啶-2-基	3-吡啶基	
16.346	CH ₃	嘧啶-2-基	3-吡啶基	
16.347	CH ₃	2-噻吩基	4-吡啶基	
16.348	CH ₃	3-噻吩基	4-吡啶基	
16.349	CH ₃	2-吡啶基	4-吡啶基	
16.350	CH ₃	3-吡啶基	4-吡啶基	
16.351	CH ₃	4-吡啶基	4-吡啶基	
16.352	CH ₃	吡嗪基	4-吡啶基	
16.353	CH ₃	喹啉-2-基	4-吡啶基	
16.354	CH ₃	喹啉-4-基	4-吡啶基	
16.355	CH ₃	嘧啶-2-基	4-吡啶基	
16.356	CH ₃	嘧啶-2-基	4-吡啶基	
16.357	CH ₃	2-噻吩基	2-噻吩基	
16.358	CH ₃	3-噻吩基	2-噻吩基	
16.359	CH ₃	2-吡啶基	2-噻吩基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (88)

表 16 (續)

化合物	R ₂	R ₃	R ₇	特性/評註
16.360	CH ₃	3-吡啶基	2-噻吩基	
16.361	CH ₃	4-吡啶基	2-噻吩基	
16.362	CH ₃	吡咭基	2-噻吩基	
16.363	CH ₃	喹啉-2-基	2-噻吩基	
16.364	CH ₃	喹啉-4-基	2-噻吩基	
16.365	CH ₃	嘧啶-2-基	2-噻吩基	
16.366	CH ₃	嘧啶-2-基	2-噻吩基	
16.367	CH ₃	2-噻吩基	3-噻吩基	
16.368	CH ₃	3-噻吩基	3-噻吩基	
16.369	CH ₃	2-吡啶基	3-噻吩基	
16.370	CH ₃	3-吡啶基	3-噻吩基	
16.371	CH ₃	4-吡啶基	3-噻吩基	
16.372	CH ₃	吡咭基	3-噻吩基	
16.373	CH ₃	喹啉-2-基	3-噻吩基	
16.374	CH ₃	喹啉-4-基	3-噻吩基	
16.375	CH ₃	嘧啶-2-基	3-噻吩基	
16.376	CH ₃	嘧啶-2-基	3-噻吩基	
16.377	CH ₃	2-噻吩基	吡咭基	
16.378	CH ₃	3-噻吩基	吡咭基	
16.379	CH ₃	2-吡啶基	吡咭基	
16.380	CH ₃	3-吡啶基	吡咭基	
16.381	CH ₃	4-吡啶基	吡咭基	
16.382	CH ₃	吡咭基	吡咭基	
16.383	CH ₃	喹啉-2-基	吡咭基	
16.384	CH ₃	喹啉-4-基	吡咭基	
16.385	CH ₃	嘧啶-2-基	吡咭基	
16.386	CH ₃	嘧啶-2-基	吡咭基	
16.387	CH ₃	2-噻吩基	喹啉-4-基	
16.388	CH ₃	3-噻吩基	喹啉-4-基	

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (89)

表 16 (續)

化合物	R_2	R_3	R_7	特性/評註
16.389	CH ₃	2-吡啶基	喹啉-4-基	
16.390	CH ₃	3-吡啶基	喹啉-4-基	
16.391	CH ₃	4-吡啶基	喹啉-4-基	
16.392	CH ₃	吡嗪基	喹啉-4-基	
16.393	CH ₃	喹啉-2-基	喹啉-4-基	
16.394	CH ₃	喹啉-4-基	喹啉-4-基	
16.395	CH ₃	嘧啶-2-基	喹啉-4-基	
16.396	CH ₃	嘧啶-2-基	喹啉-4-基	

表 17 :

化合物 17.1 至 17.396 是式 V 的化合物 ($X=N$ 且 $Z=O$)，其中的取代基 R_2 ， R_3 及 R_7 如表 16 所定義。

表 18 :

化合物 18.1 至 18.396 是式的 VII 化合物 ($X=N$ 且 $Z=NH$)，其中的取代基 R_2 ， R_3 及 R_7 如表 16 所定義。

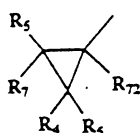
表 1 至 18 中使用的 Ph 是代表苯基。

流程 A 中描述式 (I) 化合物的製備，其中 X 是 CH 或是 N，且 Z 是 O (式 IV 及式 V 的化合物)。將環丙基肼 (III) 與經適當取代的苯甲基衍生物 (II) 反應，其中 Z 是鹵素，如溴，氯或是碘，以苯甲基溴化為佳。在室溫下，將以通式 (III) 代表的經環丙基取代肼以合適的鹼處理使生成陰離子，再以苯甲基溴化物 (II) 加成。一般採用的鹼是金屬氫化物，如氫化鈉，烷氧化物，如甲氧化鈉及氫氧化物鹼，如氫氧化鈉或是鉀，以及鹼金屬，如碳酸鈉或是碳酸鉀。一般用於氫化物鹼的溶劑是 N,N-二甲基甲醯胺 (DMF) 及四氫呋喃

五、發明說明 (90)

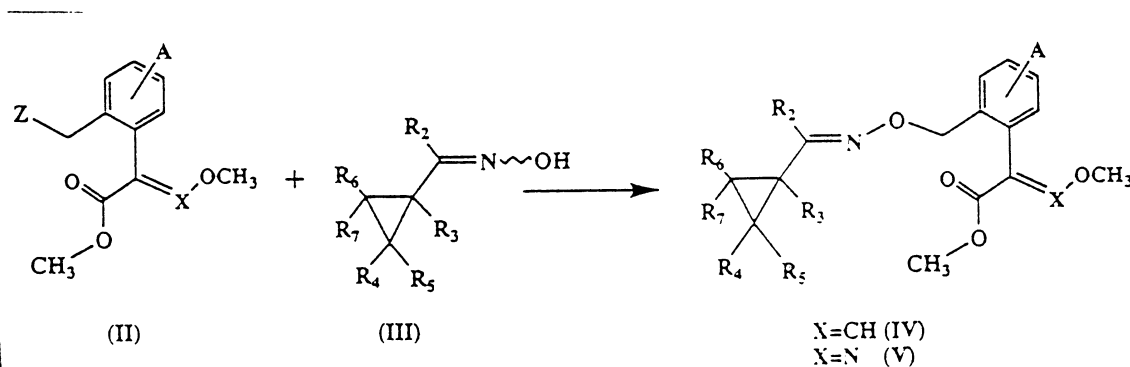
(THF)；用於鹼氧化物鹼的溶劑是DMF，THF，甲基乙基酮(MEK)及丙酮，用於鹼金屬的溶劑是DMF，丙酮及MEK。

如流程A所示，在 $C(R_2)=N-O-$ 中的N-O鍵是在E位置(假設



是較大的取代基)。同時Z異構物可以混合物的方式生產。當生產異構物時，其被標明為異構物A(在薄層層析中，其 R_f 較高)，及異構物B(在薄層層析中，其 R_f 較低)。可以利用傳統的技術測定異構物A或B擁有E或Z的立體結構，例如以X射線結晶圖法，或是以光譜法，如，核磁共振光譜法。在本發明化合物中，異構物A被設定是E亞胺氧基結構，而異構物B是Z亞胺氧基結構。

流程A

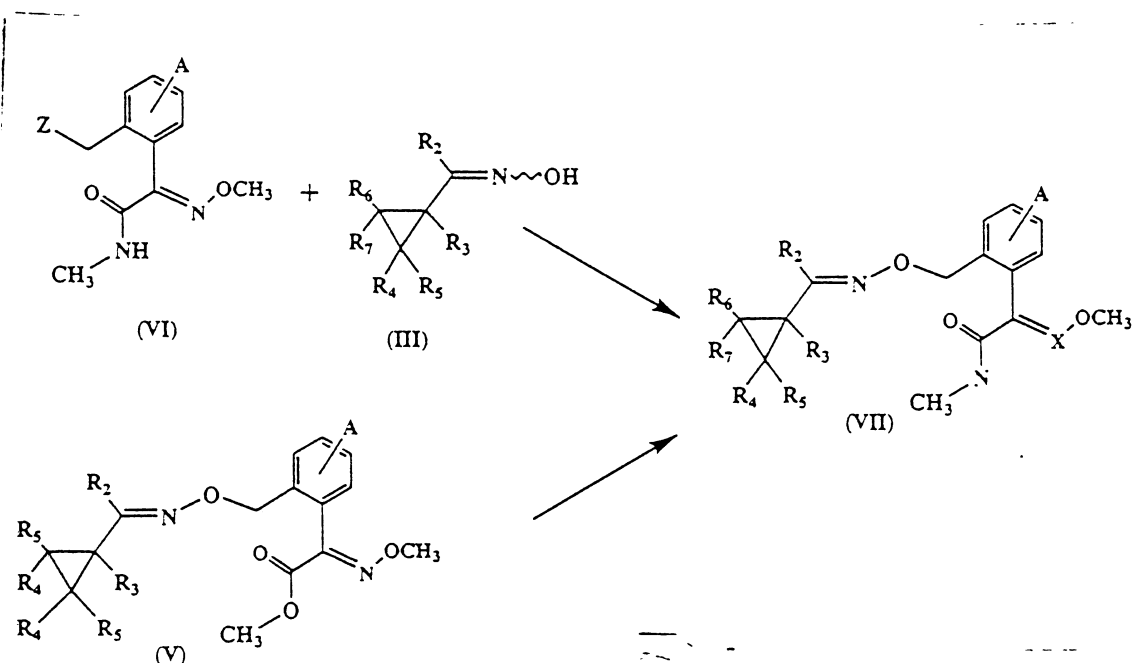


式IV化合物(X是CH)的製備是以E- α -(2-溴甲基苯基)- β -甲氧基丙烯酸甲酯，在鹼存在下，較佳是在NaOH或是KOH，在溶劑中，較佳是丙酮或是甲基乙基酮中進行烷基化反應。若僅有單一的E異構物，美國專利字號4,914,127，第3-4欄中已提出由2-甲基苯基乙酸以兩個步驟

五、發明說明 (91)

製備 E- α -(2-溴甲基苯基)- β -甲氧基丙烯酸甲酯。在鹼存在下，較佳是 NaOH 或是 KOH，在溶劑中，較佳是丙酮或是甲基乙基酮，將 E-2-(溴甲基)苯基乙醛酸甲酯 O-甲基肼反應製備式 V 的化合物 (X=N)。以美國專利第 4,999,042 號，第 17-18 欄及第 5,157,144 號，第 17-18 欄敘述的方式製備 E-2-(溴甲基)苯基乙醛酸甲酯 O-甲基肼。在鹼性條件下，以烷基亞硝酸鹽處理 2-甲基苯基乙酸甲酯以製備 2-(溴甲基)苯基乙醛酸甲酯 O-甲基肼使於甲基化後得 2-甲基苯基乙醛酸甲酯 O-甲基肼，其亦可由 2-甲基苯基乙醛酸甲酯製備，使經 2-羥胺氯化氫及甲基化處理，或以甲氧胺氯化氫處理製備。

流程 B



如流程 B 中所示，式 VII 之化合物 (X 是 N) 可利用將羥亞胺乙酸鹽 (V) 進行胺解作用來製備。美國專利第 5,185,342

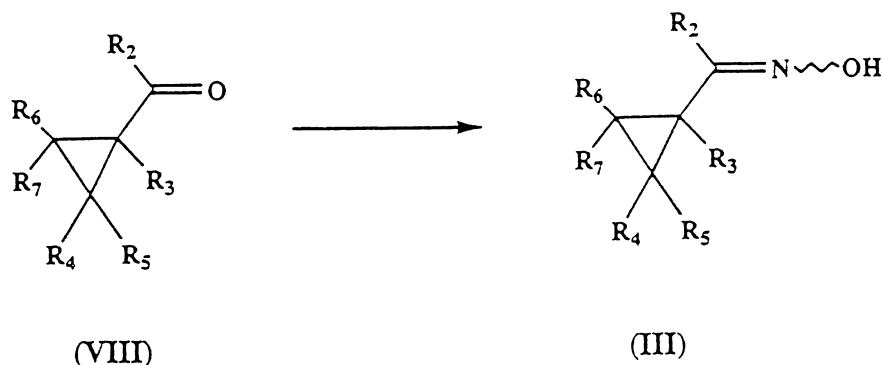
五、發明說明 (92)

號，第22，48及57欄，以及第5,221,691號，第26-27欄，及第5,407,902號，第8欄中敘述將羥亞胺乙酸鹽(V)進行胺解作用生成羥亞胺乙醯胺。例如，表2中的式V化合物，其中X是N且Z是O，以40%溶於甲醇中的甲胺水性液處理，可得表3之式VII化合物，其中Z是NH。另外，如流程B所示，將未飽和的中間產物肟(III)，於鹼存在下，如氫氧化物鹼，與N-甲基(E)-2-甲氧基亞胺基-2-[2-(溴甲基)苯基]-乙醯胺反應，較佳於溶劑中反應，如丙酮或是甲基乙基酮，以獲得表II之式(VII)化合物N-甲基(E)-2-甲氧基-亞胺基-2-[2-(溴甲基)苯基]乙醯胺，這於美國專利第5,387,714號，第13欄中有描述。

如流程C所示，通式(III)之肟的獲取法是將相應的環丙基醛或是酮(VIII)與羥胺氯化氫在室溫至迴流溫度下反應，較佳是在室溫下，於適當的溶劑中，如甲醇或是乙醇，在合適的鹼存在下進行，如氫氧化鈉，碳酸鉀或是吡啶。以羥胺合成肟的一般敘述在進階有機化學，3月份，第4版，第906-907頁中提出，並列入本篇參考文獻。當所獲取的通式(III)之肟是順式或是反式肟異構物的混合物，可將其分離為單一的異構物，且如流程A及B所述加以烷基化。通當式(III)之肟混合物被用在流程A及B時，將式IV，V及VII的化合物以傳統的色譜技術分離為個別的異構物。

五、發明說明 (93)

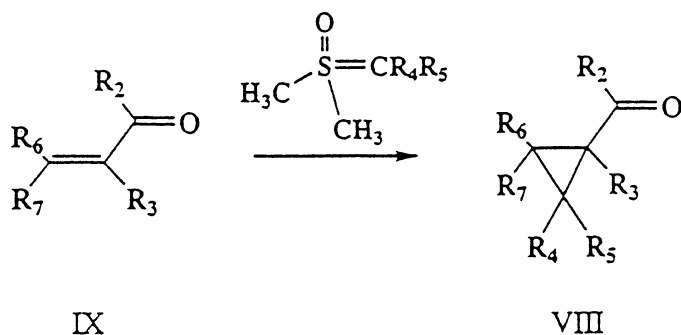
流程 C



可利用傳統的技術製備環丙醛或是酮(VIII)。其不飽和的中間產物IX(流程D)與硫炔化物反應，其於鹼存在下由二甲基亞碲鹽製備，可獲得經取代的噻基環丙烷，VIII。硫炔化物化學的描述如Troost及Melvin，硫炔化物，學術版，紐約，NY 1975，及Block，有機硫化合物的反應，第91-123頁，學術版，紐約，NY 1978。一般由二甲基亞碲鹽生成硫炔化物的典型反應條件係利用鹼，如氫氧化物，金屬氫化物及烷氧化物，其於溶劑中，如二甲氧基乙烷，二甲基亞碲及水，其係根據所使用的鹼而異。該反應於0-20°C中進行，較佳由10-15°C中進行，且與溶於二甲基亞碲中鹼金屬氫氧化物反應為佳。一般而言，二甲基亞碲甲基炔化物係於室溫下，於粉狀氫氧化鈉存在下，由溶於二甲基亞碲的三甲基亞碲碘製備。趁攪拌，在室溫下，將環丙醛或酮滴加至炔化物中。

五、發明說明 (94)

流程 D



如流程 E 所示，可獲得通式 (III') 的肟，其中 R_2 是 $C(R_{10})=N-OR_9$ 。將酮 X，其中 R_{10} 不是 H，或是醛，其 R_{10} 是 H，將其與烷基亞硝酸鹽，如第三丁基亞硝酸鹽或是異戊基亞硝酸鹽，在鹼性條件下反應以獲得相應的 α -肟亞胺環丙酮 XI。一般將溶於溶劑中，如第三-丁醇及烷基亞硝酸鹽之環丙酮或是醛加入含鹼，如第三丁氧化鈉的第三-丁醇溶劑中，並於室溫下攪拌。使 α -羥亞胺環丙酮 XI 經烷基化生成 α -(經取代)羥亞胺環丙酮 XII。使酮基環丙肟 XII 如流程 C 處理以獲得雙肟 III'。

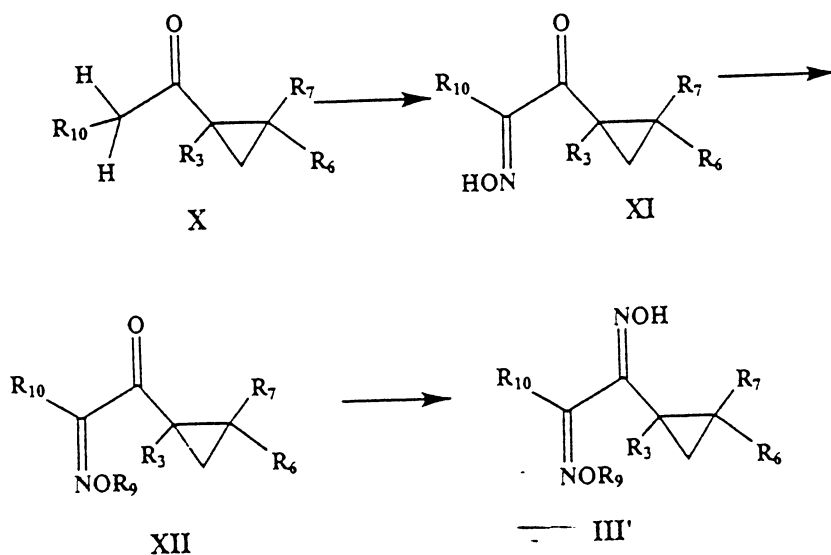
(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (95)

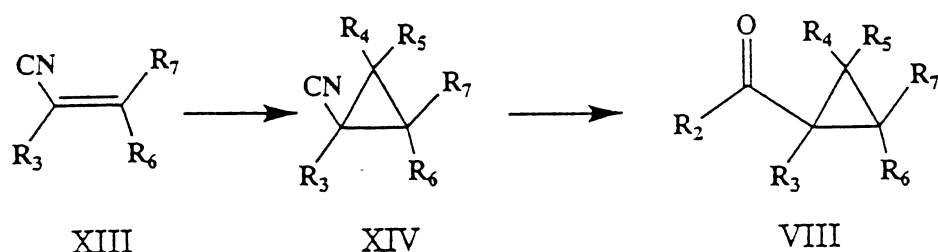
流程 E



α, β -未飽和醛或是酮IX可利用傳統的縮合技術製備。於合成 α, β -未飽和醛或是酮(烯酮)的詳述如進階有機化學，3月份，第4版，第937-955頁所述，並列入本篇之參考文獻。例如有機反應，第16冊中描述了一般酮及醛的醛醇縮合反應。如本發明式IX之中間產物，一般而言其酮或是醛可為 R_7COR_6 ，其中 R_7 及 R_6 的定義如前述。當 R_6 是氫，該醛是例如苯甲醛或雜環醛。該酮是 $R_2COCH_2R_3$ ，其中 R_2 及 R_3 的定義如前述。一般而言，酮 $R_2COCH_2R_3$ 可溶於氫氧溶劑中，如甲醇或是乙醇，並以滴加方式加入醛 R_7COR_6 ，再加入鹼或是另外加入溶於水性鹼溶液中的醛溶液。常用的是鹼金屬氫氧化物，如氫氧化鋇、鉀或是鈉，並於 $0^\circ C$ 至 $35^\circ C$ 下進行滴加的動作，尤以室溫為佳。當烯酮是衍生自丙酮(R_2 是甲基且 R_3 是氫)，該溶劑以丙酮為佳，再接著添加 R_7COR_6 及水性氫氧化物溶液。

五、發明說明 (96)

流程 F



另外， α, β -未飽和環丙酮 VIII 可由環丙腈 XIV 來製備，如流程 F 所述，其將腈 XIII 進行環丙基化來進行。流程 F 中的起始物，腈 XIII，可利用傳統的合成法來製備，如進階有機化學，3 月份，第 4 版，第 937-955 頁，且列入本篇參考文獻。例如，將腈衍生物 R_3CH_2CN 與酮或是醛 R_7COR_6 ，在鹼存在下進行縮合反應，可獲得腈 XIII。較佳地， R_3CH_2CN 中的 R_3 是如前所定義之芳基或是雜芳基。一般而言，腈是溶於溶劑中，如乙醇或是水，再加入醛或是酮後，添加鹼。常用的鹼是鹼金屬氫氧化物，如氫氧化鉍、鉀及鈉，而且通常在室溫下攪拌該混合物。

將腈 XIII 以流程 D 的方式以硫炔化物處理，可獲得環丙腈 XIV。利用對腈進行有機金屬加成，再使水解使環丙腈 XIV 轉換為環丙酮。例如，將標準試劑 Grignard 試劑 R_2MgX 或是有機鋰試劑， R_2Li 加入腈官能性可獲得酮 VIII'。腈加成反應如進階有機化學，3 月份，第 4 版，第 935-936 頁中所述，且列入本篇參考文獻。

利用標準還原法將環丙腈 XIV 轉為環丙醛 VIII' (其中 R_2 是 H)，如以氫化二異丁基鋁 (DiBAL) 進行。將腈進行還原生

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

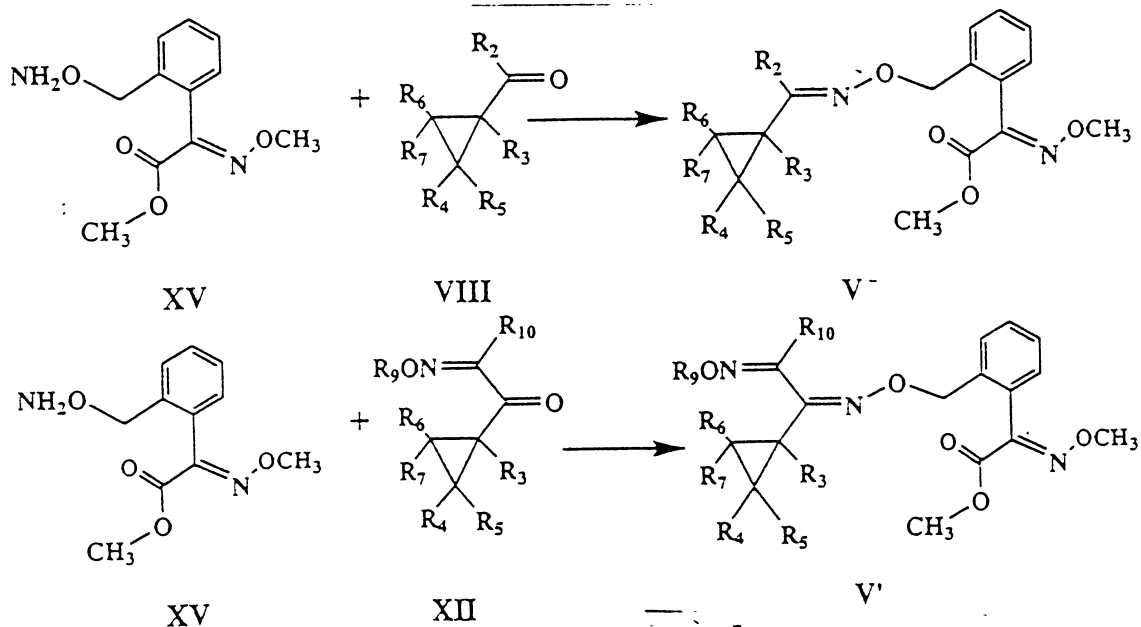
訂

五、發明說明 (97)

成醛的方式，如進階有機化學，3月份，第4版，第919-920頁中所述，且列入本篇參考文獻。

式V或是VII化合物的直接合成如流程G所示。式V或是VII化合物的製備可直接來自將官能化的環丙酮或是醛，VIII，與胺氧基中間產物XV進行縮合反應。胺氧基中間產物XV的製備如US5194662所述。胺氧基中間產物XV的製備係以兩個步驟進行，將II(其中X是N)以N-羥基酞醯亞胺進行烷基化，再以聯胺處理可獲得XV。將胺氧基中間產物XV與酮或是醛VIII縮合可獲得V，並且與環丙酮XII專一性的反應獲得V'。將式V的化合物如流程B所示來處理可獲得VII。

流程 G



本發明化合物可根據下述步驟製備：

範例 1

五、發明說明 (98)

製備(E)-3-甲氧基-2-[2-((((環丙基-反-(2-(3'-氯苯基)環丙基)伸甲基)胺基)氧基)甲基)苯基]戊烯酸甲酯

表1之化合物 1.102

製備反-3-(3'-氯苯基)-1-環丙基-2-戊烯-1-酮

加入5.0克(0.059莫耳，1.0當量)的環丙基甲基酮，50毫升的乙醇，及50毫升的水至250毫升備有磁石攪拌子的圓底燒瓶中。加入部份的3-氯苯甲醛(8.3克，0.059莫耳，1.0當量)，再加入0.4克的85%氫氧化鉀。將燒瓶塞緊，並在室溫下攪拌過夜。將反應混合物倒入200毫升的水中，並分別以100毫升的乙醚萃取3次。將醚萃取液以100毫升的飽和亞硫酸鈉溶液洗，再以100毫升的水，及100毫升的飽和氯化鈉溶液清洗。使醚萃取液於無水硫酸鎂上乾燥，使過濾後於迴旋蒸發器上濃縮後，可得11.4克的黃色液體(94%產率)，其與所需的產物一致，反-3-(3'-氯苯基)-1-環丙基-2-戊烯-1-酮，以300 MHz ^1H NMR分析。

^1H NMR : (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.0 (m, 2H), 1.2 (m, 2H), 2.2 (m, 1H), 6.9 (d, 1H), 7.3-7.6 (m, 5H)。

製備反-2-(3'-氯苯基)-環丙基-環丙基酮

加入12.2克(0.0553莫耳，1.0當量)的三甲基亞砷化碘，2.2克(0.0553莫耳，1.0當量)的粉狀氫氧化鈉，及150毫升的二甲基亞砷至500毫升備有磁石攪拌子，氮氣入口及均壓添加漏斗的圓底燒瓶中。於室溫下將該溶液攪拌30分鐘，再滴加溶於100毫升二甲基亞砷之反-3-(3'-氯苯基)-1-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

始

五、發明說明 (99)

環丙基-2-戊烯-1-酮。使該反應於室溫下攪拌過夜。將反應混合物倒入200毫升水中，並分別以100毫升的乙醚萃取3次。將醚萃取液以2次的100毫升水洗，再以100毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取液於無水硫酸鎂上乾燥，使過濾後迴旋蒸發器上濃縮後，可得9.3克的濃黃色液體(76%分離率)，其與所需的產物一致，反-2-(3'-氯苯基)-環丙基-環丙基酮，以300 MHz ^1H NMR分析。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 0.9 (m, 2H), 1.1 (m, 2H), 1.3 (m, 1H), 1.7 (m, 1H), 2.1 (m, 1H), 2.3 (m, 1H), 2.6 (m, 1H), 6.9 (m, 1H), 7.1 (s, 1H), 7.2-7.3 (m, 2H)。

製備反-2-(3'-氯苯基)-環丙基-環丙基胺

加入2.0克(0.0091莫耳，1.0當量)的反-2-(3'-氯苯基)-環丙基-環丙基酮，1.6克(0.022莫耳，2.4當量)的脛胺氯化氫，及50毫升的無水甲醇至100毫升備有磁石攪拌子的圓底燒瓶中。將該溶液攪拌迴流90分鐘，使冷卻並於迴旋蒸發器中濃縮。將所得的殘餘溶於100毫升的乙醚中，將醚萃取液以2次的50毫升水洗，再以100毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取液於無水硫酸鎂上乾燥，使過濾後於迴旋蒸發器上濃縮後，可得1.4克的濃稠膠狀半固體。使所得的初產物於矽膠上以50%乙酸乙酯，50%己烷進行層析分離。將純分液混合後，於迴旋蒸發器上濃縮可得0.9克的白色固體(42%分離率)其與所需的產物一致，反-2-(3'-氯苯基)-環丙基-環丙基胺，以300 MHz ^1H NMR分

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (100)

析，其為肱異構物的E/Z混合物。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 0.8 (m, 2H), 0.9 (m, 2H), 1.3 (m, 1H), 1.4-1.5 (m, 1H), 1.6 (m, 1H), 2.0 (m, 1H), 2.6-2.8 (m, 1H), 6.9 (m, 1H), 7.1 (m, 1H), 7.2-7.3 (m, 2H), 9.0 (bs, 1H)。

製備(E)-3-甲氧基-2-[2-(((環丙基-(反-(2-(3'-氯苯基)環丙基)伸甲基)胺基)氧基)甲基)苯基]-戊烯酸甲酯

加入0.9克(0.00383莫耳，1.0當量)的反-2-(3'-氯苯基)環丙基環丙基肱，1.1克(0.00383莫耳，1.0當量)的第三丁氧化鉀，及10毫升的無水二甲基甲醯胺至20毫升備有磁石攪拌子的玻璃試管中。將該溶液於室溫下攪拌10分鐘，再接著加入一部份的(E)- α -[2-(溴甲基)苯基]- β -甲氧基丙烯酸甲酯。將該玻璃管加蓋，並將該反應於室溫下攪拌過夜。將該反應混合物倒入100毫升的水中，並以2次50毫升的乙醚萃取。將該乙醚萃取液以2次50毫升的水洗，再以100毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使該醚萃取液於無水硫酸鎂上乾燥，過濾後以迴旋蒸發器濃縮可得1.2克的濃稠紅色油狀物。將初產物以20%乙酸乙酯，80%己烷於矽膠上進行層析分離。將純分液混合後，於迴旋蒸發器上濃縮可得0.8克的澄清無色油(45%分離率)，其與所需的產物一致，經300 MHz ^1H NMR分析後，其為(E)-3-甲氧基-2-[2-(((環丙基-(反-(2-(3'-氯苯基)環丙基)伸甲基)胺基)氧基)甲基)苯基]-戊烯酸甲酯的E及Z亞胺混合物。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 0.6-0.9 (m,

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (101)

4H), 1.1 (m, 2H), 1.5 (m, 1H), 2.4 (m, 1H), 2.6 (m, 1H), 3.6-3.7 (d, 3H), 3.8-4.0 (d, 3H), 4.9-5.0 (d, 2H), 6.9 (m, 1H), 7.0 (m, 1H), 7.2-7.4 (m, 6H), 7.6 (d, 1H)。

範例 2

製備 E 及 Z 亞胺：(E,E)及(Z,E)2-[2-((((反-1-(2-(4'-甲氧基苯基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基-亞胺基乙酸甲酯

表 2 的化合物 2.23A 及 2.23B

製備反-4-(4-甲氧基苯基)-3-丁烯-2-酮

加入 12.8 克 (0.22 莫耳) 的丙酮，100 毫升的乙醇及 1 毫升的水至 250 毫升備有磁石攪拌子的圓底燒瓶中。加入一部份對-茴香醛 (3.0 克，0.022 莫耳，1.0 當量)，再加入 0.2 克的氫氧化鋇單水合物 (催化劑)。將燒瓶塞緊，並於室溫下攪拌過夜。將該反應混合物倒入 200 毫升水中，並且分別以 100 毫升的乙醚萃取 3 次。將乙醚萃取液以 100 毫升的飽和亞硫酸鈉水溶液清洗，再以 100 毫升的水洗，再以 100 毫升飽和氯化鈉水溶液清洗。使該乙醚萃取液於無水硫酸鎂上乾燥，過濾後於迴旋蒸發器上濃縮，可獲得 3.2 克的黃色油狀物 (83% 分離率)，經 300 MHz ^1H NMR 分析，其與所需的產物，反-4-(4-甲氧基苯基)-3-丁烯-2-酮一致。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 2.4 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 6.6 (d, 1H), 6.9 (d, 2H), 7.5 (m, 3H)。

製備反-2-(4'-甲氧基苯基)環丙基甲基酮

加入 4.0 克 (0.0182 莫耳，1.0 當量) 的三甲基碘化亞砷，

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (102)

0.73克(0.0182莫耳，1.0當量)的粉狀氫氧化鈉，及100毫升的二甲基亞砷至250毫升備有磁石攪拌子，氮氣入口及均壓添加漏斗的圓底燒瓶中。使該溶液於室溫下攪拌30分鐘，再加入一部份的反-4-(4-甲氧基苯基)-3-丁烯-2-酮。將該深紅色溶液於室溫下攪拌15分鐘。將該反應混合物倒入200毫升的水中，並且分別以100毫升的乙醚萃取3次。將乙醚萃取液分別以100毫升的水洗2次，再以100毫升飽和氯化鈉水溶液清洗。使該乙醚萃取液於無水硫酸鎂上乾燥，過濾後於迴旋蒸發器上濃縮，可獲得2.6克的濃稠黃色液體(75%分離率)，經300 MHz ^1H NMR分析，其與所需的產物，反-2-(4'-甲氧基苯基)環丙基甲基酮一致。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.3 (m, 1H), 1.6 (m, 1H), 2.2 (m, 1H), 2.3 (s, 3H), 2.6 (m, 1H), 6.8 (d, 2H), 7.1 (d, 2H)。

製備E及Z亞胺異構物：(E,E)及(Z,E) 2-[2-(((反-1-(2-(4'-甲氧基苯基)-環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯

加入(0.7克，0.0037莫耳，1.0當量)的反-2-(4'-甲氧基苯基)環丙基甲基酮，10毫升的無水甲醇，及1.0克(0.0041莫耳，1.1當量)的(E)-2-(胺基氧基-甲基)苯基乙醛酸甲酯O-甲肟至25毫升備有磁石攪拌子的玻璃試管中。將該玻璃管加蓋，並將該反應於室溫下攪拌過夜。將該反應混合物倒入100毫升的水中，並以3次100毫升的乙醚萃取。將該乙醚萃取液以2次100毫升的水洗，再以100毫升的飽和氯化

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

始

五、發明說明 (103)

鈉水溶液清洗。使該醚萃取液於無水硫酸鎂上乾燥，過濾後以迴旋蒸發器濃縮可得1.7克的初產物，E/Z 2-[2-((((反-1-(2-(4'-甲氧基苯基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯為琥珀色油狀物。將產物以30%乙酸乙酯/70%己烷於矽膠上進行層析分離。由管柱中按次序沖提出450毫克的黏稠黃色液體，異構物A，經300 MHz ^1H NMR分析知其與所需的產物E亞胺一致，其為(E,E)-2-[2-((((反-1-(2-(4'-甲氧基苯基)環丙基)亞乙胺)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基乙酸甲酯，以及420毫克的黏稠黃色油狀物，異構物B，經300 MHz ^1H NMR分析知其與所需的產物Z亞胺一致，其為(Z,E)-2-[2-((((反-1-(2-(4'-甲氧基苯基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯。經純化後總產率為60%。

異構物A，E亞胺，NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.1 (m, 1H), 1.3 (m, 1H), 1.7 (m, 1H), 1.75 (s, 3H), 2.1 (m, 1H), 3.8 (s, 3H), 3.9 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.8-6.9 (m, 3H), 7.0 (d, 1H), 7.2 (m, 1H), 7.4-7.7 (m, 3H)。

異構物B，Z亞胺，NMR : (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.1-1.4 (m, 2H), 1.6 (s, 3H), 2.2 (m, 1H), 2.6 (m, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.8 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.8-6.9 (m, 3H), 7.0 (d, 1H), 7.2 (m, 1H), 7.4-7.7 (m, 3H)。

製備(E)-2-(胺基氧基甲基)苯基乙醛酸甲酯O-甲肟(E)-2-

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂

五、發明說明 (104)

(O-酞醯胺氧基甲基)苯基乙醛酸甲酯O-甲胛

加入5.1克(0.0315莫耳)N-羥基酞醯胺，1.3克(0.0315莫耳)的氫氧化鈉，及300毫升的無水二甲基甲醯胺至乾燥的500毫升配有磁石攪拌子之圓底燒瓶中。將該深紅色的溶液於室溫下攪拌20分鐘，再添加部份的2-(溴甲基)苯基乙醛酸甲酯O-甲胛(15克，60%純度，0.0315莫耳)。使該反應於室溫下攪拌過週末，再倒入800毫升的水中，並攪拌1小時可得到白色的固體，經真空過濾收集，再以水，己烷清洗，並於40℃中使真空乾燥過夜。所分離的11.5克白色固體(98%分離產率)經300 MHz ^1H NMR分析知其與所需的產物一致，其為(E)-2-(O-酞醯胺氧基甲基)苯基乙醛酸甲酯O-甲胛。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 3.8 (s, 3H), 3.95 (s, 3H), 5.0 (s, 2H), 7.1 (d, 1H), 7.5 (m, 2H), 7.7-7.9 (m, 5H)。

製備(E)-2-(胺基氧基甲基)苯基乙醛酸甲酯O-甲胛

加入11.4克(0.031莫耳)的(E)-2-(O-酞醯胺氧基甲基)苯基乙醛酸甲酯O-甲胛，100毫升的無水二甲基甲醯胺，及1.9克(0.034莫耳)的聯胺單水合物至250毫升配有磁石攪拌子之圓底燒瓶中。將該燒瓶塞緊，並使該反應於室溫下攪拌2小時。以過濾除去所得的固體，並以迴轉蒸發器濃縮濾液。將殘餘以100毫升的醚溶解，過濾清除後可得7.4克的濃稠黃色油狀物(100%分離產率)，經300 MHz ^1H NMR分析知其與所需的產物一致，其為(E)-2-(胺基氧基甲基)苯

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (105)

基乙醛酸甲酯 O-甲肟。將其儲存在 -20°C 中直到需要分析時使用。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 3.87 (s, 3H), 4.03 (s, 3H), 4.6 (s, 2H), 4.9 -5.4 (bs, 2H), 7.2 (m, 1H), 7.4-7.5 (m, 3H)。

範例 3

製備 E 及 Z 亞胺異構物：(E,E)及(Z,E)-N-甲基 2-[2-((((反-1-(2-(4'-甲氧基苯基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙醯胺

表 3 之 3.23A 及 3.23B 化合物

加入 210 毫克 (0.512 毫莫耳) 的化合物 2.23A, E 亞胺, (E,E) 2-[2-((((反-1-(2-(4'-甲氧基苯基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯, 10 毫升的無水甲醇, 及 1.0 毫升 (12.9 毫莫耳) 的 40% 甲胺水溶液至乾燥的 100 毫升配有磁石攪拌的圓底燒瓶中。將該燒瓶塞緊, 並於室溫下攪拌過週末。將該溶液倒入 100 毫升的水中, 並分別以 50 毫升的乙醚清洗 3 次。將乙醚萃取液以 100 毫升的水洗 2 次, 再以 100 毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。將醚萃取液於無水硫酸鎂乾燥, 過濾後於迴轉蒸發器上濃縮, 可得 210 毫克的濃稠黃色油狀物 (100% 分離率), 經 300 MHz ^1H NMR 分析知其與所需的產物一致, 其為 (E,E)-N-甲基 2-[2-((((反-1-(2-(4'-甲氧基苯基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙醯胺。

化合物 3.23A, 異構物 A, E 亞胺, NMR (300 MHz, ^1H ,

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (106)

CDCl₃ , TMS=0 ppm) 1.1 (m, 1H) , 1.3 (m, 1H) , 1.7 (m, 1H) , 1.75 (s, 3H) , 2.1 (m, 1H) , 2.9 (d, 3H) , 3.8 (s, 3H) , 3.95 (s, 3H) , 4.95 (s, 2H) , 6.7 (bs, 1H) , 6.8-6.9 (m, 3H) , 7.0 (d, 1H) , 7.2 (m, 1H) , 7.4-7.7 (m, 3H) 。

重複上述方法以製備 0.23 克的化合物 2.23B , Z 亞胺 , (Z,E) 2-[2-((((反-1-(2-(4'-甲氧基苯基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯, 同時可獲得 0.23 克的 (Z,E) 2-[2-((((反-1-(2-(4'-甲氧基苯基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙醯胺, 其經 300 MHz ¹H NMR 分析, 達 100% 分離產率。

化合物 3.23B , 異構物 B , Z 亞胺 , NMR (300 MHz , ¹H , CDCl₃ , TMS=0 ppm) 1.1-1.4 (m, 2H) , 1.6 (s, 3H) , 2.2 (m, 1H) , 2.7 (m, 1H) , 2.75 (d, 3H) , 3.8 (s, 3H) , 3.95 (s, 3H) , 4.95 (s, 2H) , 6.6 (bs, 1H) , 6.8-6.9 (m, 3H) , 7.0 (d, 1H) , 7.2 (m, 1H) , 7.4-7.7 (m, 3H) 。

範例 4

製備 E 及 Z 亞胺異構物 : (E,E) 及 (Z,E) 2-[2-((((反-1-(2-(苯基環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯

表 2 之 2.11 , 2.11A 及 2.11B 化合物

製備反-2-苯基環丙基甲基酮

加入 150 克的三甲基碘化亞砷 (0.685 莫耳 , 1.0 當量) , 28 克的粉狀氫氧化鈉 (0.685 莫耳 , 1.0 當量) 及 1000 毫升的 DMSO 至 2000 毫升配有磁石攪拌的圓底燒瓶中。將該燒瓶

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

五、發明說明 (107)

塞緊，加入100克的部份反-4-苯基-3-丁烯-2-酮(0.685毫莫耳)，並於室溫下使攪拌15分鐘。再於室溫下使攪拌5分鐘，將該溶液倒入500毫升的水中，並分別以200毫升的乙醚萃取3次。將乙醚萃取液連續以200毫升的水洗2次，再以200毫升的鹽水清洗。將醚萃取液於無水硫酸鎂乾燥，過濾後並脫水。可分離出94克的黃色液體(86%分離率)，經300 MHz ^1H NMR分析知其與所需的產物一致，其為反-2-環丙基甲基酮。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.3 (m, 1H), 1.7 (m, 1H), 2.2 (m, 1H), 2.3 (s, $\overline{3\text{H}}$), 2.6 (m, 1H), 7.1 (d, 2H), 7.2-7.4 (m, 3H)。

製備E及Z亞胺：(E,E)及(Z,E) 2-[2-((((反-1-(2-(苯基環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯

加入7.3克溶於100毫升的甲醇中的反-2-苯基環丙基甲基酮(0.045毫莫耳，1.0當量)，及16.2克的(E)-2-(胺基氧基甲基)苯基乙醛酸甲酯O-甲肟(0.0685毫莫耳，1.52當量)至250毫升配有磁石攪拌及迴流濃縮器的圓底燒瓶中。使反應加熱迴流2小時，再取分液以毛細管GC分析。不殘留任何的起始物，同時發現2種新產物其比率約為70%/30%。使反應冷卻並倒入200毫升的水中，分別以100毫升的乙醚萃取3次。將乙醚萃取液以100毫升的水洗2次，再以100毫升的0.1 N HCl及100毫升的飽和NaCl溶液清洗。使醚萃取液於無水 MgSO_4 上乾燥，過濾後使脫水可得17.2克的濃稠黃色油狀物之初產物(可定量的產率)，經300 MHz ^1H NMR及

五、發明說明 (108)

毛細管 GC 分析知其與 (E,E) 及 (Z,E) 2-[2-((((反-1-(2-(苯基環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯一致，其含部份的亞胺 (~70% E 至 30% Z)。

將 1.0 克的化合物 2.11 (化合物 2.11A 及 2.11B 的混合物) 於矽膠上以 25% 乙酸乙酯 / 75% 己烷進行色層分析，其依沖提順序可由管柱中獲得 500 毫克的黏稠黃色液體，異構物 A，經 300 MHz ^1H NMR 分析後知其與所需的產物一致，其為 E 亞胺，(E,E)-2-[2-((((反-1-(2-(苯基環丙基)-亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯，以及 250 毫克的黏稠黃色油狀物，異構物 B，經 300 MHz ^1H NMR 分析後知其與所需的產物一致，其為 Z 亞胺，(Z,E)-2-[2-((((反-1-(2-(苯基環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯。經純化後的回收率是 75%。

化合物 2.11A：異構物 A，E 亞胺，NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.2 (m, 1H), 1.4 (m, 1H), 1.75 (s, 3H), 1.8 (m, 1H), 2.2 (m, 1H), 3.8 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 7.1 (d, 2H), 7.2 (m, 2H), 7.3 (m, 2H), 7.4-7.5 (m, 3H)。

化合物 2.11B：異構物 B，Z 亞胺，NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.2 (m, 1H), 1.3 (m, 1H), 1.65 (s, 3H), 2.2 (m, 1H), 2.7 (m, 1H), 3.7 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 7.1-7.2 (m, 4H), 7.3 (m, 2H), 7.4-7.5 (m, 3H)。

範例 5

製備 E 及 Z 亞胺：(E,E) 及 (Z,E)-N-甲基 2-[2-((((反-1-(2-(苯

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (109)

基環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙醯胺

表3之化合物3.11, 3.11A及3.11B

加入溶於100毫升甲醇之17.2克的化合物2.11, 其為(E,E)及(Z,E) 2-[2-(((反-1-(2-(苯基環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯(0.0453莫耳, 1.0當量)之70:30混合物, 及5.3克溶於水中之40%甲胺至(0.0679莫耳, 1.5當量)至乾燥的250毫升配有磁石攪拌的圓底燒瓶中。將燒瓶塞緊並於室溫下攪拌過夜。以毛細管氣相層析儀分析該分液。發現不殘留任何的起始物, 同時發現2種新產物其比率約為70%/30%。使反應物倒入200毫升的水中, 分別以100毫升的乙醚萃取3次。將乙醚萃取液以100毫升的水洗2次, 再以100毫升的0.1 N HCl及100毫升的飽和NaCl溶液清洗。使醚萃取液於無水MgSO₄上乾燥, 過濾後使脫水可得15.1克的濃稠黃色油狀物之初產物, 經300 MHz ¹H NMR及毛細管GC分析知其與(E,E)及(Z,E)-N-甲基2-[2-(((反-1-(2-(苯基環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙醯胺之70:30亞胺氧基混合物一致, 其經分離的產率是88%。

將1.5克的化合物3.11於矽膠上以30% EtOAc/70%己烷進行層析分析, 使由管柱中沖提出1100毫克的黏稠黃色液體, 異構物A, 經300 MHz ¹H NMR分析後知其與所需的產物一致, 其為E亞胺, (E,E)-2-[2-(((反-1-(2-(苯基環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯, 以及350毫克的黏稠黃色油狀物, 異構物B, 經300

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (110)

MHz ^1H NMR 分析後知其與所需的產物一致，其為 Z 亞胺，(Z,E)-2-[2-((((反-1-(2-(苯基環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯。經純化後的回收率是 97%。

化合物 3.11A，異構物 A，E 亞胺，NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.2 (m, 1H), 1.4 (m, 1H), 1.75 (s, 3H), 1.8 (m, 1H), 2.2 (m, 1H), 2.9 (d, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.7 (bs, 1H), 7.1 (d, 2H), 7.2 (m, 2H), 7.3 (m, 2H), 7.4-7.5 (m, 3H)。

化合物 3.11B，異構物 B，Z 亞胺，NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.2 (m, 1H), 1.3 (m, 1H), 1.65 (s, 3H), 2.2 (m, 1H), 2.7 (m, 1H), 2.8 (d, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.6 (bs, 1H), 7.1-7.2 (m, 4H), 7.3 (m, 2H), 7.4-7.5 (m, 3H)。

範例 6

製備 E 及 Z 亞胺：(E,E)及(Z,E) 2-[2-((((反-1-(2-(2-噻吩基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯

表 11 之化合物 11.50A 及 11.50B

製備反-4-(2-噻吩基)-3-丁烯-2-酮

加入 13.4 克 (0.267 莫耳，1.0 當量) 的丙酮，100 毫升的乙醇及 1 毫升的水至 250 毫升配有磁石攪拌的圓底燒瓶中。加入一部份的 2-噻吩羧醛 (3.0 克，0.0267 莫耳，1.0 當量)，再加入 0.2 克的氫氧化鋇單水合物 (催化劑)。將該燒瓶塞緊，並於室溫下攪拌過夜。將反應混合物倒入 200 毫升的水

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

編

五、發明說明 (111)

中，分別以100毫升的乙醚萃取3次。將乙醚萃取液以100毫升飽和的亞硫酸鈉溶液清洗，再以100毫升的水及100毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取液於無水硫酸鎂上乾燥，過濾後，以迴旋蒸發器濃縮可得3.5克的琥珀色油狀物，經300 MHz ^1H NMR分析知其與所需的產物，反-4-(2-噻吩基)-3-丁烯-2-酮一致。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 2.3 (s, 3H), 6.5 (d, 1H), 7.1 (m, 1H), 7.3 (m, 1H), 7.4 (m, 1H), 7.6 (d, 1H)。

製備反-2-(2-噻吩基)環丙基甲基酮

加入5.1克(0.023莫耳，1.0當量)的三甲基碘化亞砷，0.92克(0.023莫耳，1.0當量)的粉狀氫氧化鈉及100毫升的二甲基亞砷至250毫升配有磁石攪拌，氮氣入口及均壓添加漏斗的圓底燒瓶中。使該溶液於室溫下攪拌30分鐘，再添加一部份的反-4-(2-噻吩基)-3-丁烯-2-酮。將該暗紅色的溶液於室溫下攪拌15分鐘。將反應混合物倒入200毫升的水中，分別以100毫升的乙醚萃取3次。將乙醚萃取液以100毫升的水洗2次及以100毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取液於無水的硫酸鎂上乾燥，過濾後，以迴旋蒸發器濃縮可得初產物，使其於矽膠上以90%己烷，10%乙酸乙酯進行層析分析。將純分液混合後，以迴旋蒸發器濃縮可得分離率29%的1.1克的濃稠白黃色液體，經300 MHz ^1H NMR分析知其與所需的產物，反-2-(2-噻吩基)環丙基甲基酮一致。

五、發明說明 (112)

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.4 (m, 1H), 1.7 (m, 1H), 2.2 (m, 1H), 2.3 (s, 3H), 2.7 (m, 1H), 6.8 (m, 1H), 6.9 (m, 1H), 7.1 (m, 1H)。

製備 (E,E) 及 (Z,E) 2-[2-((((反-1-(2-(2-噻吩基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯

加入 10 毫升溶於無水甲醇之反-2-(2-噻吩基)環丙基甲基酮 (0.6 克, 0.0036 莫耳, 1.0 當量), 及 0.95 克 (0.0040 莫耳, 1.1 當量) 之 (E)-2-(胺基氧基甲基)-苯基乙醛酸 O-甲肟至 25 毫升配有磁石攪拌的玻璃試管中。將試管加蓋後使於室溫下攪拌過夜。將溶液倒入 100 毫升的水中, 分別以 100 毫升的乙醚萃取 3 次。將乙醚萃取液以 100 毫升的水洗 2 次, 再以 100 毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取液於無水硫酸鎂上乾燥, 過濾後, 於迴轉蒸發器上濃縮可得 1.6 克初產物之琥珀色油狀物。將該產物以 30% EtOAc/70% 己烷於矽膠上進行層析由管柱中沖提出 580 毫克的黏稠黃色液體, 經 300 MHz ^1H NMR 分析後知其與 E 亞胺, (E,E)-2-[2-((((反-1-(2-(2-噻吩基)環丙基)亞乙基)-胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯一致, 其於純化後之分離的產率是 65%。

化合物 11.50A, 異構物 A, E 亞胺, NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.1 (m, 1H), 1.3 (m, 1H), 1.76 (s, 3H), 1.8 (m, 1H), 2.3 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 4.05 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.7 (m, 1H), 6.9 (m, 1H), 7.1 (d, 1H), 7.2 (d, 1H), 7.3-7.5 (m, 3H)。

化合物 11.50B, 異構物 B, Z 亞胺, NMR (300 MHz, ^1H ,

五、發明說明 (113)

CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.2 (m, 1H) , 1.3 (m, 1H) , 1.63 (s, 3H) , 2.5 (m, 1H) , 2.7 (m, 1H) , 3.77 (s, 3H) , 4.0 (s, 3H) , 4.95 (s, 2H) , 6.7 (m, 1H) , 6.9 (m, 1H) , 7.1 (d, 1H) , 7.2 (d, 1H) , 7.3-7.5 (m, 3H) 。

範例 7

製備 E 及 Z 亞胺 : (E,E) 及 (Z,E)-N-甲基 2-[2-(((反-1-(2-(2-噻吩基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙醯胺

表 12 之化合物 12.50A 及 12.50B

加入 200 毫克 (0.544 毫莫耳) 溶 10 毫升無水甲醇之 11.50A(E,E) 2-[2-(((反-1-(2-(2-噻吩基)環丙基)亞乙基)-胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯，及 1.0 毫升 (12.9 毫莫耳) 的 40% 甲胺水溶液至 25 毫升配有磁石攪拌的玻璃試管中。將試管加蓋後，使於室溫下攪拌過夜。將該溶液倒入 100 毫升的水中，分別以 50 毫升的乙醚萃取 3 次。將乙醚萃取液以 100 毫升的水洗 2 次，再以 100 毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取液於無水的硫酸鎂上乾燥，過濾後，於迴旋蒸發器濃縮可得 170 毫克的濃稠黃色油狀物，其分離產率是 81%。經 300 MHz ^1H NMR 分析知其與所需的產物，(E,E)-N-甲基 2-[2-(((反-1-(2-(2-噻吩基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙醯胺一致。

化合物 12.50A，異構物 A，E 亞胺，NMR (300 MHz， ^1H ， CDCl_3 ，TMS=0 ppm) 1.1 (m, 1H) , 1.3 (m, 1H) , 1.75 (s,

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (114)

3H), 1.8 (m, 1H), 2.35 (m, 1H), 2.95 (d, 3H), 3.95 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.65 (bs, 1H), 6.7 (m, 1H), 6.9 (m, 1H), 7.1 (d, 1H), 7.2 (d, 1H), 7.3-7.5 (m, 3H)。

重複該步驟製備Z亞胺，以150毫克的(Z,E) 2-[2-((((反-1-(2-(2-噻吩基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯可製備150毫克的100%分離率之濃稠黃色油狀，經300 MHz ^1H NMR分析知其與所需的產物，(Z,E)-N-甲基 2-[2-((((反-1-(2-(2-噻吩基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙醯胺一致。

化合物12.50B，異構物B，Z亞胺，NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.2 (m, 1H), 1.3 (m, 1H), 1.61 (s, 3H), 2.5 (m, 1H), 2.7 (m, 1H), 2.8 (d, 3H), 3.9 (s, 3H), 4.97 (s, 2H), 6.65 (bs, 1H), 6.7 (m, 1H), 6.9 (m, 1H), 7.1 (d, 1H), 7.2 (d, 1H), 7.3-7.5 (m, 3H)。

範例8

製備E-2-[2-(4-反-(2-苯基環丙基)-5-乙基-2,7-二氧基-3,6-二氮辛-3,5-二烯-1-基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯

表2之化合物2.144A

製備反-1-苯基-1-戊烯-3-酮

加入10.0克(0.116莫耳，1.0當量)2-戊酮，100毫升乙醇，及10毫升的水至250毫升配有磁石攪拌的圓底燒瓶中。加入一部份苯甲醛(12.3克，0.116莫耳，1.0當量)，再加入0.4克之85%氫氧化鉀。將燒瓶蓋緊，並使於室溫下攪拌過夜。將該溶液倒入200毫升的水中，分別以100毫升的乙醚

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂

五、發明說明 (115)

萃取3次。將該乙醚萃取液以100毫升的飽和的亞硫酸鈉溶液清洗，再以100毫升的水洗，再以100毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取液於無水的硫酸鎂上乾燥，過濾後，以迴旋蒸發器濃縮可得15.8克的紅色液體(78%分離率)。經300 MHz ^1H NMR分析知其與所需的產物，反-1-苯基-1-戊烯-3-酮一致。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.0 (t, 3H), 1.7 (q, 2H), 2.65 (t, 2H), 6.8 (d, 1H), 7.3-7.5 (m, 4H), 7.6 (m, 2H)。

製備反-2-苯基環丙基-正-丙基酮

加入19.4克(0.0879莫耳，1.0當量)的三甲基碘化亞砷，3.5克(0.0879莫耳，1.0當量)的粉狀氫氧化鈉，及150毫升的二甲基亞砷至500毫升配有磁石攪拌，氮氣入口，及均壓添加漏斗的圓底燒瓶中。使該溶液於室溫下攪拌30分鐘，再滴加溶於50毫升二甲基亞砷之反-1-苯基-1-戊烯-3-酮(15.3克，0.0879莫耳)。使該反應於室溫下攪拌過夜，將該溶液倒入200毫升的水中，分別以100毫升的乙醚萃取3次。將該乙醚萃取液以100毫升的水洗2次，再以100毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取液於無水的硫酸鎂上乾燥，過濾後，以迴旋蒸發器濃縮可得14.2克的濃稠褐色液體(86%分離率)。經300 MHz ^1H NMR分析知其與所需的產物，反-2-苯基環丙基-正-丙基酮一致。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 0.95 (t, 3H), 1.3 (m, 1H), 1.7 (m, 3H), 2.2 (m, 1H), 2.45 (m, 1H), 2.5

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (116)

(m, 2H), 7.0 (d, 1H), 7.1-7.5 (m, 4H)。

製備 2-羥基亞胺基-1-(反-2-苯基環丙基)-1-丁酮

加入 9.5 克(0.084 莫耳, 1.1 當量)的第三丁氧化鉀, 及 150 毫升的第三丁醇至 500 毫升配有磁石攪拌, 氮氣入口, 及均壓添加漏斗的圓底燒瓶中。使該溶液於室溫下攪拌 30 分鐘, 再快速地滴加反-2-苯基環丙基-正丙基酮(14 克, 0.075 莫耳, 1.0 當量), 26 克之 90% 第三丁腈(0.231 莫耳, 3.08 當量)及 100 毫升的第三丁醇。使該反應於室溫下攪拌過夜, 然後倒入 500 毫升的圓底燒瓶中, 並於迴轉蒸發器中濃縮。將所得的殘餘溶於 200 毫升的水中, 以 1N 的鹽酸水溶液酸化至 pH 2, 再以 100 毫升的乙醚萃取 3 次。將該乙醚萃取液以 100 毫升的水洗 2 次, 再以 100 毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取液於無水的硫酸鎂上乾燥, 過濾後, 以迴旋蒸發器濃縮可得 8.4 克的褐色固體(52% 分離率)。經 300 MHz ^1H NMR 分析知其與所需的產物, 2-羥基亞胺基-1-(反-2-苯基環丙基)-1-丁酮一致。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.0 (t, 3H), 1.4 (m, 1H), 1.8 (m, 1H), 2.6 (m, 3H), 3.1 (m, 1H), 2.5 (m, 2H), 7.1 (d, 2H), 7.2-7.4 (m, 4H)。

製備 2-甲氧基亞胺基-1-(反-2-苯基環丙基)-1-丁酮

加入 3.6 克(0.0166 莫耳, 1.0 當量)的 2-羥基亞胺基-1-(反-2-苯基環丙基)-1-丁酮, 2.3 克(0.0166 莫耳, 1.0 當量)的碳酸鉀及 100 毫升的無水二甲基甲醯胺至 100 毫升配有磁石攪拌, 氮氣入口的圓底燒瓶中。使該溶液於室溫下攪拌 10

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (117)

分鐘，再添加 2.35 克的 (0.0166 莫耳) 碘化甲烷。使該反應於室溫下攪拌過夜，然後倒入 100 毫升的水中，再以 100 毫升的乙醚萃取 3 次。將該乙醚萃取液以 100 毫升的水洗 2 次，再以 100 毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取液於無水的硫酸鎂上乾燥，過濾後，以迴旋蒸發器濃縮可得 3.4 克的褐色油狀物，使其於矽膠上以 15% 乙酸乙酯，85% 己烷進行層析。將純分液混合，並於迴轉蒸發器上濃縮可得 2.5 克的白黃色油狀物 (65% 分離率)，經 300 MHz ^1H NMR 分析知其與所需的產物，2-甲氧基亞胺基-1-(反-2-苯基環丙基)-1-丁酮一致。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.0 (t, 3H), 1.4 (m, 1H), 1.7 (m, 1H), 2.5 (q, 2H), 2.6 (m, 1H), 3.2 (m, 1H), 4.0 (s, 3H), 7.1 (d, 2H), 7.2-7.3 (m, 3H)。

製備 2-甲氧基亞胺基-1-(反-2-苯基環丙基)-1-丁酮脞

加入 2.3 克 (0.010 莫耳，1.0 當量) 的 2-甲氧基亞胺基-1-(反-2-苯基環丙基)-1-丁酮，3.5 克 (0.05 莫耳，5.0 當量) 的脞胺氯化氫，4 克 (0.05 莫耳) 的吡啶及 70 毫升的甲醇至 200 毫升配有磁石攪拌，氮氣入口的圓底燒瓶中。使該反應於室溫下攪拌過夜，然後倒入 200 毫升的水中，再以 100 毫升的乙醚萃取 3 次。將該乙醚萃取液以 100 毫升的水洗 2 次，再以 100 毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取液於無水的硫酸鎂上乾燥，過濾後，以迴旋蒸發器濃縮可得 1.9 克的黃色油狀物，使其於矽膠上以 15% 乙酸乙酯，85% 己烷進行層析。將純分液混合，並於迴轉蒸發器上濃縮 (依

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (118)

沖提順序)可得1.1克的白黃色固體，經300 MHz ^1H NMR分析知其與所需的產物，異構物A：2-甲氧基亞胺基-1-(反-2-苯基環丙基)-1-丁酮肟，以及0.25克的黃色固體，經300 MHz ^1H NMR分析分析知其與所需的產物，異構物B：2-甲氧基亞胺基-1-(反-2-苯基環丙基)-1-丁酮肟一致，其為57%的經混合後分離率。

異構物A：NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.0 (t, 3H), 1.3 (m, 1H), 1.9 (m, 1H), 2.5 (m, 1H), 2.6 (q, 2H), 2.8 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 7.1-7.4 (m, 5H), 8.5 (bs, 1H)。

異構物B：NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.0 (t, 3H), 1.2 (m, 1H), 1.6 (m, 1H), 1.95 (m, 1H), 2.4 (m, 1H), 2.7 (q, 2H), 3.95 (s, 3H), 7.1-7.4 (m, 5H), 9.5 (bs, 1H)。

製備(E) 2-[2-(4-反-(2-苯基環丙基)-5-乙基-2,7-二氧基-3,6-二氮辛-3,5-二烯-1-基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯的異構物A

加入0.8克(0.00325莫耳，1.0當量)的異構物A肟，2-甲氧基亞胺基-1-(反-2-苯基環丙基)-1-丁酮肟，0.9克(0.0065莫耳，2.0當量)的碳酸鉀，及100毫升的無水二甲基甲醯胺至100毫升配有磁石攪拌，氮氣入口的圓底燒瓶中。將該混合物於室溫下攪拌10分鐘，再添加1.25克(0.00325莫耳，1.0當量)的75%純2-(溴甲基)苯基乙醛酸甲酯O-甲肟。使該反應於室溫下攪拌過夜，然後倒入100毫升的水

五、發明說明 (119)

中，再以100毫升的乙醚萃取3次。將該乙醚萃取液以100毫升的水洗2次，再以100毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取液於無水的硫酸鎂上乾燥，過濾後，以迴旋蒸發器濃縮可得1.4克的褐色油狀物，使其於矽膠上以15%乙酸乙酯，85%己烷進行層析。將純分液混合，並於迴轉蒸發器上濃縮可得0.4克的澄清無色油狀物(27%分離率)，經300 MHz ^1H NMR分析知其與所需的產物，異構物A：(E) 2-[2-(4-反-(2-苯基環丙基)-5-乙基-2,7-二氧基-3,6-二氮辛-3,5-二烯-1-基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯一致。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.0 (t, 3H), 1.3 (m, 1H), 1.8 (m, 1H), 2.4 (m, 1H), 2.5 (q, 2H), 2.8 (m, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.9 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 5.0 (s, 2H), 7.1 (m, 4H), 7.2 (m, 2H), 7.4 (m, 3H)。

範例 9

製備(E)-N-甲基 2-[2-(4-反-(2-苯基環丙基)-5-乙基-2,7-二氧基-3,6-二氮辛-3,5-二烯-1-基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙醯胺

表3之化合物3.144A

加入250毫克(0.55毫莫耳)(E) 2-[2-(4-反-(2-苯基環丙基)-5-乙基-2,7-二氧基-3,6-二氮辛-3,5-二烯-1-基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯之異構物A，及50毫升的甲醇至100毫升配有磁石攪拌的圓底燒瓶中。加入一部份1.0毫升的40%甲胺水溶液(12.9毫莫耳)。將燒瓶蓋緊，並使於室溫下攪拌過夜。將該溶液倒入100毫升的水中，分別以50毫

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (129)

升的乙醚萃取3次。將該乙醚萃取液以50毫升的水洗2次，再以100毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取液於無水的硫酸鎂上乾燥，過濾後，以迴旋蒸發器濃縮可得140毫克的澄清白黃色油狀物(56%分離率)。經300 MHz ^1H NMR分析知其與主要化合物3.144一致。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 0.95 (t, 3H), 1.2 (m, 1H), 1.8 (m, 1H), 2.3 (m, 1H), 2.45 (q, 2H), 2.8 (m, 1H), 2.9 (d, 3H), 3.65 (s, 6H), 5.0 (s, 2H), 6.6 (bs, 1H), 7.0 (m, 4H), 7.2 (m, 2H), 7.4 (m, 3H)。

範例 10

製備(E)-2-[2-(((1-(1,2-二苯基環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯

表5之化合物 5.39

製備 α -苯基肉桂腈

加入3.0克(0.0256莫耳，1.0當量)苯甲基氰化物，150毫升的乙醇，及50毫升的水至250毫升配有磁石攪拌的圓底燒瓶中。加入一部份的苯甲醛(2.7克，0.0256莫耳，1.0當量)，再添加0.2克的85%氫氧化鉀。將燒瓶蓋緊，並使於室溫下攪拌過夜。將該溶液倒入200毫升的水中。經真空過濾後收集所得的沈澱，以水、己烷清洗，使於40°C中抽真空過夜可得4.4克的白色固體(84%分離率)。經300 MHz ^1H NMR分析知其與所需的化合物 α -苯基肉桂腈一致。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 7.1 (s, 1H), 7.2-7.4 (m, 6H), 7.6 (d, 2H), 7.8 (m, 2H)。

五、發明說明 (121)

製備 1,2-二苯基環丙烷碳腈

加入 4.8 克 (0.0215 莫耳，1.0 當量) 的三甲基碘化亞砷，0.86 克 (0.0215 莫耳，1.0 當量) 的粉狀氫氧化鈉，及 150 毫升的二甲基亞砷至 250 毫升配有磁石攪拌，氮氣入口及均壓添加漏斗的圓底燒瓶中。使該溶液於室溫下攪拌 30 分鐘，再滴加於 100 毫升之二甲基亞砷的 α -苯基肉桂腈。將該反應於室溫下攪拌過夜。將該反應混合物倒入 200 毫升的水中，並以 100 毫升的乙醚萃取 3 次。將乙醚萃取液以 100 毫升的水洗 2 次，再以 100 毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取液於無水硫酸鎂上乾燥，過濾，再於迴轉蒸發器濃縮可得 4.1 克的濃稠澄清無色液體，靜置使結晶 (87% 分離率)。經 300 MHz ^1H NMR 分析知其與所需的化合物，1,2-二苯基環丙烷碳腈一致。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 2.0 (m, 1H), 2.2 (m, 1H), 2.8 (m, 1H), 7.1 (m, 10H)。

製備 1,2-二苯基環丙基甲基酮

加入 1.5 克 (0.00685 莫耳，1.0 當量) 的腈，1,2-二苯基環丙烷碳腈，及 150 毫升的無水甲苯至乾燥的 500 毫升配有磁石攪拌，氮氣入口，迴流濃縮器及側臂添加漏斗的圓底燒瓶中。滴加甲基溴化鎂 (0.0137 莫耳，2.0 當量，4.6 毫升溶於醚中的 3.0 M 溶液)，再將反應迴流 2 小時。使反應冷卻後，小心地以 100 毫升的飽和氯化銨水溶液使反應停止，並以 100 毫升的乙醚萃取 3 次。將醚萃取液以 100 毫升的水洗 2 次，再以 100 毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (122)

液於無水硫酸鎂上乾燥，過濾，再於迴轉蒸發器濃縮可得 1.4 克的濃稠澄清黃色油狀物，(87%分離率)。經 300 MHz ^1H NMR 分析知其與所需的化合物，1,2-二苯基環丙基甲基酮一致。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 0.9-1.1 (m, 2H), 1.4 (m, 1H), 1.9 (s, 3H), 7.1-7.4 (m, 10H)。

製備(E)-2-[2-((((1-(1,2-二苯基環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯

加入 0.8 克(0.0034 莫耳，1.0 當量)的 1,2-二苯基環丙基甲基酮，50 毫升的無水甲苯，約 204A 分子篩，及 0.9 克(0.0037 莫耳，1.1 當量)的(E)-2(胺基氧基甲基)苯基乙醛酸 O-甲肼至 50 毫升配有磁石攪拌及迴流濃縮器的圓底燒瓶中。將反應迴流 2.5 小時，冷卻後，以濾紙過濾去除不溶物。將濾液倒入 100 毫升的水中，並以 50 毫升的乙醚萃取 3 次。將醚萃取液以 100 毫升的水洗 2 次，再以 100 毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使醚萃取液於無水硫酸鎂上乾燥，過濾，再於迴轉蒸發器濃縮可得 1.4 克的濃稠琥珀色液體，使其於矽膠上以 20% 乙酸乙酯，80% 己烷經層析分析。將純分液混合，於迴轉蒸發器上濃縮可得 460 毫克的濃稠澄清無色油狀物(30%分離率)。經 300 MHz ^1H NMR 分析知其與所需的化合物，(E)-2-[2-((((1-(1,2-二苯基環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-~~甲~~甲氧基亞胺基乙酸甲酯一致。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.3 (s, 3H),

五、發明說明 (123)

1.35 (m, 1H), 2.2 (m, 1H), 2.8 (m, 1H), 3.75 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 5.0 (s, 2H), 7.1-7.4 (m, 14H)。

範例 11

製備 (E)-N-甲基-2-[2-(((1-(1,2-二苯基環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯表 6 之化合物 6.39

加入 300 毫克 (0.66 毫莫耳) 的 (E)-2-[2-(((1-(1,2-二苯基環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙酸甲酯，10 毫升的甲醇，及 1.0 毫升 (12.9 毫莫耳) 的 40% 甲胺水溶液至 100 毫升配有磁石攪拌的圓底燒瓶中。將燒瓶塞緊，並在室溫下攪拌過夜。將反應倒入 100 毫升的水中，並以 50 毫升的乙醚萃取 3 次。將醚萃取液以 50 毫升的水洗 2 次，再以 50 毫升的飽和氯化鈉水溶液清洗。使於無水硫酸鎂上乾燥，過濾，再於迴轉蒸發器濃縮可得 300 毫克的濃稠澄清黃色油狀物 (99% 分離率)。經 300 MHz ^1H NMR 分析知其與所需的化合物，(E)-N-甲基-2-[2-(((1-(1,2-二苯基環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙醯胺一致。

NMR (300 MHz, ^1H , CDCl_3 , TMS=0 ppm) 1.26 (s, 3H), 1.3 (m, 1H), 2.2 (m, 1H), 2.7 (d, 1H), 2.8 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 5.0 (s, 2H), 6.5 (bs, 1H), 7.1-7.4 (m, 14H)。

表 19 中顯示表 1 至 18 中典型的範例的質子 NMR 數據 (300 MHz)，並且用以說明本發明。

五、發明說明 (124)

表 19

化合物#	NMR數據
1.22A	1.1-1.2 (m, 1H), 1.3-1.4 (m, 1H), 1.79 (s, 3H), 1.8 (m, 1H), 2.1-2.2 (m, 1H), 3.67 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 4.98 (s, 2H), 6.6-6.75 (m, 3H), 7.1-7.45 (m, 5H), 7.56 (s, 1H)
1.22B	1.15-1.3 (m, 2H), 1.6 (s, 3H), 2.1-2.2 (m, 1H), 2.6-2.7 (m, 1H), 3.55 (s, 3H), 3.66 (s, 3H), 3.69 (s, 3H), 4.92 (s, 2H), 6.6 (t, 3H), 7.0-7.4 (m, 5H), 7.46 (m, 1H)
1.157	1.2-1.4 (m, 2H), 2.1 (m, 1H), 2.35 (m, 1H), 3.62-3.63 (d, 3H), 3.7-3.74 (d, 3H), 5-5.14 (d, 2H), 7-7.6 (m, 14H)
2.01A	1.3 (m, 2H), 1.8 (m, 1H), 2.2 (m, 1H), 3.8 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 7.05 (t, 3H), 7.2 (d, 2H), 7.3 (m, 2H), 7.4-7.55 (m, 3H)
2.01B	1.2 (m, 1H), 1.4 (m, 1H), 2.2 (m, 1H), 2.5 (m, 1H), 3.7 (s, 3H), 3.9 (s, 3H), 4.9 (s, 2H), 7.05 (m, 3H), 7.2 (m, 2H), 7.3 (m, 2H), 7.4-7.55 (m, 3H)
2.11A	1.2 (m, 1H), 1.4 (m, 1H), 1.75 (s, 3H), 1.8 (m, 1H), 2.2 (m, 1H), 3.8 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 7.1 (d, 2H), 7.2 (m, 2H), 7.3 (m, 2H), 7.4-7.5 (m, 3H)
2.11B	1.2 (m, 1H), 1.3 (m, 1H), 1.65 (s, 3H), 2.2 (m, 1H), 2.7 (m, 1H), 3.7 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 7.1-7.2 (m, 4H), 7.3 (m, 2H), 7.4-7.5 (m, 3H)
2.12A	1.1 (m, 1H), 1.4 (m, 1H), 1.7 (m, 1H), 1.8 (s, 3H), 2.5 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.9 (d, 1H), 7.2 (m, 3H), 7.4-7.6 (m, 4H)
2.12B	1.1-1.4 (m, 2H), 1.7 (s, 3H), 2.0 (m, 1H), 2.65 (m, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.95 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.9 (d, 1H), 7.2 (m, 3H), 7.4-7.6 (m, 4H)
2.14A	1.05-1.2 (m, 2H), 1.35 (m, 1H), 1.75 (s, 3H), 2.1 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 4.03 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.98-7.01 (d, 2H), 7.1-7.2 (m, 3H), 7.3-7.5 (m, 3H)
2.14B	1.1-1.35 (m, 2H), 1.64 (s, 3H), 2.1-2.2 (m, 1H), 2.5-2.6 (m, 1H), 3.74 (s, 3H), 3.98 (s, 3H), 4.94 (s, 2H), 7-7.1 (d, 2H), 7.15-7.5 (m, 6H)
2.20A	1.1 (m, 1H), 1.4 (m, 1H), 1.7 (m, 1H), 1.8 (s, 3H), 2.1 (m, 1H), 3.8 (s, 3H), 4.1 (s, 3H), 5.0 (s, 2H), 6.8-7.1 (m, 4H), 7.2 (d, 1H), 7.4-7.8 (m, 3H)
2.20B	1.1-1.4 (m, 2H), 1.7 (s, 3H), 2.2 (m, 1H), 2.6 (m, 1H), 3.7 (s, 3H), 3.9 (s, 3H), 4.9 (s, 2H), 6.9 (t, 2H), 7.1 (m, 2H), 7.2 (m, 1H), 7.4-7.5 (m, 3H)
2.22A	1.2 (m, 1H), 1.4 (m, 1H), 1.7 (s, 3H), 1.75 (m, 1H), 2.1 (m, 1H), 3.8 (s, 3H), 3.85 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.6-6.8 (m, 3H), 7.2 (m, 2H), 7.4-7.6 (m, 3H)
2.22B	1.2-1.4 (m, 2H), 1.65 (s, 3H), 2.2 (m, 1H), 2.6 (m, 1H), 3.7 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.6-6.8 (m, 3H), 7.2 (m, 2H), 7.4-7.6 (m, 3H)
2.144A	1.0 (t, 3H), 1.3 (m, 1H), 1.8 (m, 1H), 2.4 (m, 1H), 2.5 (q, 2H), 2.8 (m, 1H), 3.75 (s, 3H), 3.9 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 5.0 (s, 2H), 7.1 (m, 4H), 7.2 (m, 2H), 7.4 (m, 3H)
3.01A	1.25 (m, 2H), 1.7 (m, 1H), 2.1 (m, 1H), 2.8 (d, 3H), 3.9 (s, 3H), 4.85 (s, 2H), 6.6 (bs, 1H), 7.05 (t, 3H), 7.2 (d, 2H), 7.3 (m, 2H), 7.4-7.55 (m, 3H)

五、發明說明 (125)

表 19 (續)

化合物#	NMR數據
3.01B	1.2 (m, 1H), 1.4 (m, 1H), 2.2 (m, 1H), 2.5 (m, 1H), 2.75 (d, 3H), 3.95 (s, 3H), 5.0 (s, 2H), 6.6 (bs, 1H), 7.1 (m, 3H), 7.2 (m, 2H), 7.3 (m, 2H), 7.4-7.55 (m, 3H)
3.11A	1.2 (m, 1H), 1.4 (m, 1H), 1.75 (s, 3H), 1.8 (m, 1H), 2.2 (m, 1H), 2.9 (d, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.7 (bs, 1H), 7.1 (d, 2H), 7.2 (m, 2H), 7.3 (m, 2H), 7.4-7.5 (m, 3H)
3.11B	1.2 (m, 1H), 1.3 (m, 1H), 1.65 (s, 3H), 2.2 (m, 1H), 2.7 (m, 1H), 2.8 (d, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.6 (bs, 1H), 7.1-7.2 (m, 4H), 7.3 (m, 2H), 7.4-7.5 (m, 3H)
3.12A	1.2 (m, 1H), 1.4 (m, 1H), 1.7 (m, 1H), 1.8 (s, 3H), 2.4 (m, 1H), 2.9 (d, 3H), 3.95 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.7 (bs, 1H), 6.9 (d, 1H), 7.2 (m, 3H), 7.4-7.6 (m, 4H)
3.12B	1.1-1.4 (m, 2H), 1.7 (s, 3H), 1.9 (m, 1H), 2.65 (m, 1H), 2.85 (d, 3H), 3.95 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.7 (bs, 1H), 6.9 (d, 1H), 7.2 (m, 3H), 7.4-7.6 (m, 4H)
3.14A	0.95-1.1 (m, 1H), 1.2-1.3 (m, 1H), 1.6-1.75 (m, 4H), 1.95-2.05 (m, 1H), 2.81-2.83 (d, 3H), 3.87 (s, 3H), 4.87 (s, 2H), 6.55-6.7 (bs, 1H), 6.91-6.94 (d, 2H), 7.05-7.45 (m, 6H)
3.14B	1.1-1.3 (m, 2H), 1.56 (s, 3H), 2.05-2.15 (m, 1H), 2.45-2.55 (m, 1H), 2.73-2.75 (d, 3H), 3.83 (s, 3H), 4.87 (s, 2H), 6.55-6.7 (bs, 1H), 6.96-6.99 (d, 2H), 7.1-7.45 (m, 6H)
3.20A	1.1 (m, 1H), 1.4 (m, 1H), 1.6 (m, 1H), 1.7 (s, 3H), 2.1 (m, 1H), 2.8 (d, 3H), 3.9 (s, 3H), 4.9 (s, 2H), 6.7 (bs, 1H), 6.8-7.2 (m, 4H), 7.2 (d, 1H), 7.4-7.7 (m, 3H)
3.22A	1.1 (m, 1H), 1.4 (m, 1H), 1.7 (s, 3H), 1.75 (m, 1H), 2.1 (m, 1H), 2.8 (d, 3H), 3.8 (s, 3H), 3.95 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.6-6.8 (m, 4H), 7.2 (m, 2H), 7.4-7.6 (m, 3H)
3.22B	1.1-1.4 (m, 2H), 1.65 (s, 3H), 2.2 (m, 1H), 2.65 (m, 1H), 2.8 (d, 2H), 3.8 (s, 3H), 3.95 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.6-6.8 (m, 4H), 7.2 (m, 2H), 7.4-7.6 (m, 3H)
3.28A	1.05-1.1 (m, 1H), 1.3-1.4 (m, 1H), 1.69 (s, 3H), 1.7-1.75 (m, 1H), 2.1-2.2 (m, 1H), 2.81-2.83 (d, 3H), 3.88 (s, 3H), 4.87 (s, 2H), 6.55-6.7 (bs, 1H), 7.05-7.5 (m, 8H)
3.28B	1.1-1.35 (m, 2H), 1.58 (s, 3H), 2.1-2.2 (m, 1H), 2.5-2.6 (m, 1H), 2.73-2.74 (d, 3H), 3.82 (s, 3H), 4.88 (s, 2H), 6.5-6.65 (bs, 1H), 7.05-7.45 (m, 8H)
3.144	0.95 (t, 3H), 1.2 (m, 1H), 1.8 (m, 1H), 2.3 (m, 1H), 2.45 (q, 2H), 2.8 (m, 1H), 2.9 (d, 3H), 3.65 (s, 6H), 5.0 (s, 2H), 6.6 (bs, 1H), 7.0 (m, 4H), 7.2 (m, 2H), 7.4 (m, 3H)
5.01	1.6 (m, 1H), 1.95 (m, 1H), 2.8 (m, 1H), 3.70 (s, 3H), 3.95 (s, 3H), 4.77 (s, 2H), 7.1-7.6 (m, 15H)
5.39	1.28 (s, 3H), 1.3 (m, 1H), 2.25 (m, 1H), 2.8 (m, 1H), 3.75 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 7.0-7.5 (m, 12H)
6.01	1.55 (m, 1H), 2.0 (m, 1H), 2.75 (s, 3H), 2.8 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 4.75 (s, 2H), 6.4 (bs, 1H), 7.1-7.6 (m, 15H)

五、發明說明 (126)

表 19 (續)

化合物#	NMR數據
6.39	1.26 (s, 3H), 1.3 (m, 1H), 2.2 (m, 1H), 2.7 (d, 3H), 2.8 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 5.0 (s, 2H), 6.5 (bs, 1H), 7.1-7.4 (m, 14H)
11.50A	1.1 (m, 1H), 1.3 (m, 1H), 1.76 (s, 3H), 1.8 (m, 1H), 2.3 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 4.05 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.7 (m, 1H), 6.9 (m, 1H), 7.1 (d, 1H), 7.2 (d, 1H), 7.3-7.5 (m, 3H)
11.50B	1.2 (m, 1H), 1.3 (m, 1H), 1.63 (s, 3H), 2.5 (m, 1H), 2.7 (m, 1H), 3.77 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.7 (m, 1H), 6.9 (m, 1H), 7.1 (d, 1H), 7.2 (d, 1H), 7.3-7.5 (m, 3H)
11.121A	1.2 (m, 1H), 1.5 (m, 1H), 1.77 (s, 3H), 1.8 (m, 1H), 2.2 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 4.03 (s, 3H), 4.96 (m, 2H), 7.2 (m, 2H), 7.3-7.5 (m, 4H), 8.4 (m, 2H)
11.121B	1.3 (m, 1H), 1.4 (m, 1H), 1.66 (s, 3H), 2.2 (m, 1H), 2.7 (m, 1H), 3.75 (s, 3H), 4.0 (s, 3H), 4.95 (m, 2H), 7.2 (m, 2H), 7.3-7.5 (m, 4H), 8.45 (m, 2H)
12.50A	1.1 (m, 1H), 1.3 (m, 1H), 1.75 (s, 3H), 1.8 (m, 1H), 2.35 (m, 1H), 2.95 (d, 3H), 3.95 (s, 3H), 4.95 (s, 2H), 6.65 (bs, 1H), 6.7 (m, 1H), 6.9 (m, 1H), 7.1 (d, 1H), 7.2 (d, 1H), 7.3-7.5 (m, 3H)
12.50B	1.2 (m, 1H), 1.3 (m, 1H), 1.61 (s, 3H), 2.5 (m, 1H), 2.7 (m, 1H), 2.8 (d, 3H), 3.9 (s, 3H), 4.97 (s, 2H), 6.65 (bs, 1H), 6.7 (m, 1H), 6.9 (m, 1H), 7.1 (d, 1H), 7.2 (d, 1H), 7.3-7.5 (m, 3H)

範例 12

將本發明的多種化合物於活體上測試其對下述疾病的抗真菌活性。將該化合物溶於 1 : 1 之丙酮及甲醇混合物，2 : 1 : 1 或是 N,N-二甲基甲醯胺，並以 2 : 1 : 1 之水、丙酮及甲醇(體積比)混合物稀釋以獲得適當的濃度。將該溶液噴灑於植物上，使其乾燥 2 小時。以真菌孢子種入植物。將每一項試驗所使用的控制植物噴灑適當的溶劑及植入。對於保護性的試驗，於本發明化合物處理植物一天後植入。有關每項試驗的技術其他部份如下述，其伴隨著以每公頃 100 或 150 公克的劑量以化合物 # 抗多種真菌所得的結果。相較於未經處理的植株，該結果以疾病控制百分比表

五、發明說明 (127)

示，100代表完全控制，0代表無控制。將測試真菌孢子施用於測試植物如下述：

小麥銹葉病(WLR)

將隱匿柄銹菌(f. sp. tritici)於溫室中在7日大的小麥(cultivar Fielder)上培養12天。以鋁箔收集葉片上的孢子。以250微米開口的篩網潔淨孢子，並以乾燥儲存。於一個月中使用該乾燥孢子。於每毫升的Soltrol油中添加20毫克(九百五十萬個孢子)的乾燥孢子以製備孢子懸浮液。將該懸浮液分配至裝載在油噴灑器上的明膠膠囊(0.7毫莫升的容量)內。每22平方英尺的7日大小麥，cultivar Fielder使用一個膠囊。等待15分鐘後使油自小麥葉片上揮發，將植物放置於暗室(18-20°C，100%相對濕度)中24小時。將植物放置在溫室中，並於12天後評估發病情況。

小麥葉片斑點症(SNW)

將小麥穎枯殼針孢在20°C的培養箱中以Czapek-Dox V-8果汁瓊膠培養盤培養，以12小時照光，12小時黑暗的狀況培養2星期。將帶有真菌的培養盤於去離子水中振盪，並以乳酪布過濾可獲得孢子的水懸浮液。將包含孢子的水懸浮液稀釋至每毫升 3.0×10^6 孢子數的濃度。以DeVilbiss噴灑器於一星期大的，已事先噴灑過真菌化合物的Feilder小麥上噴灑使植入。將經噴灑的植物置入20°C的濕度箱中，使12小時照光，12小時黑暗的狀況培養7天。將經植入的植株移至20°C的經控制環境中培養2天。將疾病的控制情況以控制百分比表示。

五、發明說明 (128)

小麥粉黴(WPM)

將禾白粉菌(f. sp. tritici)於小麥植株上，cultivar Fielder在18℃的溫控室中培養。由培養的植物上將粉黴孢子搖下至事先噴灑殺真菌化合物的7日大的小麥植株上。將經植入的植株於18℃的溫控室中培養，並澆水。於植入後7天評估疾病控制百分比。將疾病的控制情況以控制百分比表示。

小黃瓜粉黴(CPM)

將單絲殼於溫室中於小黃瓜，cultivar Bush Champion上培養。植入液的製備是將5至10片經粉黴嚴重感染的葉片放置於500毫升含水的玻璃罐中，同時，於每100毫升水中加入1滴Tween 80(聚氧乙基單油酸酯)。將葉片及液體振盪後，使植入液以乳酪布過濾，並以注射瓶噴灑在植物上。其孢子含量是100,000孢子/毫升。將該植物放在溫室中使感染及培養。7天後評估。將疾病的控制情況以控制百分比表示。

蕃茄晚期枯萎病(TLB)

將馬鈴薯晚疫病菌於添加青豆的瓊脂膠上培養2-3個星期。以水將孢子由瓊脂膠上洗下，並以DeVilbiss噴灑器噴灑至3星期大的Pixie蕃茄葉片上，其已事先噴灑本發明的化合物。將經植入的植物於20℃的濕度箱中使感染24小時。再將該植物移至20℃及90%濕度的控制環境中。5天後記錄該植物的疾病控制情況。

葡萄毛粉黴(GDM)

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (129)

使葡萄霜黴病菌於葡萄上，cultivar Delaware，於20℃，帶濕度的空氣及光度的溫控室中生長7-8天。由被感染的葉片上製備孢子的水性懸浮液，並將孢子濃度調整至約每毫升的水中含 3×10^5 個孢子。以DeVilbiss噴灑器由葉面下噴灑Delaware葡萄至葉片上有小水滴出現以植入。將經植入的植物於20℃的濕度箱中培養24小時。將該植物移至20℃的環境控制室中。於植入後7天記錄疾病的控制情況，以控制百分比表示。

稻米枯萎症(RB)

將黑黴於馬鈴薯右旋糖瓊脂膠上培養2-3個星期。以每100毫升含有1滴Tween 80的水，將孢子由瓊脂膠上洗下，以兩層的乳酪布將孢子懸浮液過濾後，調整孢子數至 5×10^5 個孢子。以DeVilbiss噴灑器將孢子懸浮液噴灑在12天大的稻米上，cultivar M-1。將經植入的植物於20℃的濕度箱中培養36小時使感染。感染後將植物放置於溫室中。6天後記錄疾病的控制情況。疾病的控制情況，以控制百分比表示。

小黃瓜毛粉黴(CDM)

於溫室中培養小黃瓜。收集大片且完全延展的葉片。以棉花包裹莖部，並將葉片放在大型的皮氏盤中(15公分的直徑)，以玻璃柱支撐葉片。將培養盤的上蓋移去，並且以本發明的化合物噴灑小黃瓜葉片的上表面。使該葉片於空氣中風乾約2小時。將古巴假霜黴於小黃瓜上培養。將該葉片於水中振盪以獲取孢子後，以每毫升100,000個孢子

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

編

五、發明說明 (130)

的濃度噴灑經處理小黃瓜葉片的下表面。再將其放回 20℃ 及 90% 濕度的控制環境中培養 5 天。其後觀察葉片上疾病的發展情況。疾病的控制情況，以控制百分比表示。

小黃瓜炭疽病(CA)

將真菌病原菌葫蘆刺盤孢於馬鈴薯右旋糖瓊脂膠(PDA)上，在 22℃ 的黑暗中培養 8-14 天。以蒸餾水加上 0.5% v/w 酵母萃取液沖洗培養盤表面使由 PDA 取得葫蘆刺盤孢的孢子。以鈍器刮取真菌菌落的上表面至大部份的孢子掉落在水性環境中。以乳酪布過濾孢子懸浮液，添加更多的水，其中包括酵母萃取液，調整孢子數至每毫升中包含 3.0×10^6 個孢子。

經化學處理的小黃瓜，cultivar Bush Champion 僅有 15 天大。以手動擠壓瓶噴灑孢子懸浮液至植物的葉片上表面至噴完。將該植物置於螢光噴霧室(12 小時照光，12 小時黑暗)中 48 小時。在感染後，將植物放入 25℃，90% 濕度的生長室中培養 3 天。評估經處理植物的疾病控制情況。疾病的控制情況，以控制百分比表示。

甜鐘椒的葡萄串症(BOT)

將真菌病原菌灰葡萄孢於馬鈴薯右旋糖瓊脂膠(PDA)上，於螢光下(12 小時照光，12 小時黑暗)培養 2-3 個星期。以蒸餾水加上 0.5% v/w 酵母萃取液沖洗培養盤表面使由 PDA 取得灰葡萄孢的孢子。以鈍器刮取真菌菌落的上表面至大部份的孢子掉落在水性環境中。以乳酪布過濾孢子懸浮液，添加更多的水，其中包括酵母萃取液，調整孢子

五、發明說明 (131)

數至每毫升中包含 3.0×10^6 個孢子。

經化學處理的甜鐘椒，cultivar California Wonder 僅有 19 天大。以手動擠壓瓶噴灑孢子懸浮液至植物的葉片上表面至噴完。將該植物置於低光度噴霧室(12 小時照光，12 小時黑暗)中，22℃，4-5 天。評估經處理植物的疾病控制情況。疾病的控制情況，以控制百分比表示。

當以每公頃 300 克的方式測試抗小麥銹葉病的結果，化合物 1.11，1.22A，1.22B，1.27，1.61A，1.61B，1.102，1.105，1.155，2.67 及 3.67 展現 99% 或是更佳的控制；當以每公頃 150 克的方式測試的結果，化合物 2.11，2.12A，2.13A，2.19，2.21A，2.22A，2.24，2.25A，2.27，2.28，2.37A，3.11，3.11A，3.12A，3.13A，3.20A，3.25A，3.26A，3.37A，3.28A 及 11.50A 展現 99% 或是更佳的控制。

當以每公頃 300 克的方式測試抗小麥葉片斑點病的結果，化合物 1.11，1.22A，1.27，1.67，1.102 及 3.67 展現 90% 或是更佳的控制；當以每公頃 150 克的方式測試的結果，化合物 2.11，2.19，2.22A，2.24，2.26A，3.11，3.11A，3.14A，3.21A，3.22A，3.23A，3.28A 及 12.98A 展現 90% 或是更佳的控制。

當以每公頃 300 克的方式測試抗小麥粉黴病的結果，化合物 1.11，1.22A，1.27，1.116，1.116A，2.67 及 3.67 展現 90% 或是更佳的控制；當以每公頃 150 克的方式測試的結果，化合物 2.11，2.11A，2.19，2.20A，2.20B，2.24，2.25A，2.26A，2.27，2.28，3.11，3.11A，3.12A，3.14A，

五、發明說明 (132)

3.19A, 3.20A, 3.24A, 3.28A, 11.50A, 11.50B, 11.98A及11.98B展現90%或是更佳的控制。

當以每公頃300克的方式測試抗小黃瓜毛粉黴的結果，化合物1.11, 1.22A, 1.27, 1.61A, 1.67, 1.102, 1.116, 2.67及3.67展現95%或是更佳的控制；當以每公頃150克的方式測試的結果，化合物2.11, 2.11A, 2.12A, 2.13A, 2.14A, 2.19, 2.20A, 2.21A, 2.24, 2.25A, 2.26A, 2.27, 2.28, 2.37A, 3.11, 3.11A, 3.11B, 3.12A, 3.14A, 3.19A, 3.20A, 3.22A, 3.23A, 3.24A, 3.26A, 3.28A, 3.34B, 3.37A, 11.50A, 11.98A, 12.50A及12.98A展現95%或是更佳的控制。

當以每公頃300克的方式測試抗蕃茄晚期枯萎症的結果，化合物1.155及2.67展現90%或是更佳的控制；當以每公頃150克的方式測試的結果，化合物1.14, 2.12A, 2.13A, 2.13B, 2.14A, 2.21A, 2.22A, 2.20B, 2.22B, 2.23A, 2.23B, 2.27, 3.11A, 3.12A, 3.12B, 3.13A, 3.13B, 3.14B, 3.19A, 3.20A, 3.20B, 3.21B, 3.24A, 3.25A, 3.24B, 3.25B, 3.26A, 3.26B, 3.27, 3.28A, 3.34B, 3.37A, 3.37B, 11.50A, 11.50B, 11.02A, 11.98A, 12.02B, 12.50B, 12.98A及12.122A展現90%或是更佳的控制。

當以每公頃300克的方式測試抗葡萄毛粉黴的結果，化合物1.11, 1.22A, 1.22B, 1.27, 1.61B, 1.67, 1.94, 1.105, 1.116, 1.155, 1.159, 1.160, 2.67及3.67展現95%或

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (133)

是更佳的控制；當以每公頃150克的方式測試的結果，化合物1.133，2.11，2.11B，3.11，3.11B及3.34B展現95%或是更佳的控制。

當以每公頃300克的方式測試抗稻米枯萎的結果，化合物1.11，1.22A，1.27，1.67及1.102展現95%或是更佳的控制；當以每公頃150克的方式測試的結果，化合物1.14，2.11，2.11A，2.14A，2.12A，2.13A，2.19，2.20A，2.21A，2.21B，2.22A，2.22B，2.23A，2.24，2.25A，2.26A，2.27，2.28，2.37A，3.11，3.11A，3.13A，3.14A，3.12A，3.19A，3.20A，3.21A，3.23A，3.24A，3.26A，3.27，3.28A，3.37A，12.60A，12.50B及12.98A展現95%或是更佳的控制。

當以每公頃150克的方式測試抗小黃瓜毛粉黴的結果，化合物2.12B，2.13A，2.13B，2.14A，2.20A，2.27，2.28，3.11，3.11A，3.13A，3.13B，3.14A，3.14B，3.20B，3.24B，3.25B，12.50A，12.98A及12.98B展現95%或是更佳的控制。

當以每公頃150克的方式測試抗甜鐘椒葡萄串症的結果，化合物2.14A，2.18，2.24，2.25A，3.13B，3.14A，3.14B，3.25B及11.50A展現90%或是更佳的控制。

當以每公頃300克的方式測試抗小黃瓜炭疽病的結果，化合物1.11，1.22A，1.27，1.102，1.105及3.67展現95%或是更佳的控制；當以每公頃150克的方式測試的結果，化合物1.14，2.12A，2.13A，2.20A，3.11，3.11A，3.12A，

五、發明說明 (134)

3.13A , 3.14A , 3.19A , 3.20A , 3.24A , 3.26A , 3.27 , 3.28A , 3.37A , 12.98A 展現 95% 或是更佳的控制。

本發明化合物可用做農業用的殺真菌劑，而且可用在數種區域，如種子，欲保護植物的土壤或是葉片。

本發明化合物可利用常用的方法做為殺真菌劑的噴灑液，如，傳統的高體積水流噴灑，低體積噴灑，氣爆式噴灑，空氣噴灑及煙塵方式。稀釋及使用方式端視所採用的設備，應用的方法，要處理的植物及要控制的疾病。一般而言，本發明化合物的使用量是由約每公頃 0.005 公斤至 50 公斤，較佳地是由約每公頃 0.025 公斤至 25 公斤的活性組成分。

做為種子的保護劑，每一百公斤的種子上所包被的毒藥，其劑量速率是由約 0.05 至約 20 克，較佳是由約 0.05 至約 4 克，最佳是由 0.1 至約 1 克。做為土壤的殺真菌劑，該化合物可被土壤結合或是其施用在表面的使用速率是每公頃由約 0.02 至 20 公斤，較佳是由約 0.05 至約 10 公斤，最佳是由 0.1 至約 5 公斤。做為葉片的殺真菌劑，該毒藥施用在生長植物的速率是每公頃由約 0.01 至 10 公斤，較佳是由約 0.02 至約 5 公斤，最佳是由 0.25 至約 1 公斤。

由於本發明化合物具有殺真菌活性，因此可與其他的已知殺真菌劑共組以提供更為廣泛的活性。適當的殺真菌劑包括，但不以此為限，美國專利第 5,252,594 號所列 (特別是第 14 及 15 欄)。其他已知可與本發明化合物共組的殺真菌劑包括，代美梭模非 (dimethomorph)，西模克沙尼爾

五、發明說明 (135)

(cymoxanil)，希福祿賽麥得(thifluzamide)，福蠟拉西爾(furalaxyl)，歐福拉思(ofurace)，本那拉西爾(benalaxyl)，歐薩迪西爾(oxadixyl)，普羅帕模卡(propamocarb)，賽波福南(cyprofuram)，分披克羅尼爾(fenpiclonil)，福地西歐尼爾(fludioxonil)，皮美尼爾(pyrimethanil)，西波迪尼爾(cyprodinil)，三地空唑(triticonazole)，氟昆空唑(fluquinconazole)，美空唑(metconazole)，思必若安(spiroxamine)，卡普安(carpropamid)，氮氧思脫賓(azoxystrobin)，克列西-甲基(kresoxim-methyl)，美敏思脫賓(metominostrobin)及三氟氧思脫賓(trifloxystrobin)。

本發明化合物可有效地以多種方式使用。因為該化合物有廣效的殺真菌活性，其可被用於穀物儲存。做為殺真菌劑之化合物可用在的穀物包括，小麥，大麥，燕麥，稻米，花生，黃豆及葡萄，可用在草皮，水果，核果，蘭花，及高爾夫球場。

本發明化合物可有效地對抗的疾病範例包括，玉米及大麥的長蠕孢菌素症，小麥及大麥的毛黴症，小麥葉及莖銹症，大麥條紋及葉銹症，蕃茄早期枯萎，蕃茄晚枯萎，花生早期葉斑症，葡萄毛黴症，葡萄黑腐症，蘋果斑痂症，蘋果毛黴症，小黃瓜毛黴症，水果的褐腐症，枯萎症，黃豆毛黴症，小黃瓜炭疽病，小麥莖結症，稻米鞘枯萎症及稻米爆裂症。

範例 13

本發明的多數化合物均於活體測試其對下述昆蟲的殺昆

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (136)

蟲活體。將以下述的方法評估本發明化合物的殺昆蟲活性。將欲評估的化合物溶於適當的溶劑中，通常是丙酮，甲醇及水的混合物，以平扇的噴嘴噴灑在三片切下的葉片上。在噴灑後，使葉片乾燥。以嚼葉昆蟲感染兩片葉(南方臂蟲及墨西哥豆甲蟲)，而第三片葉於噴灑前先以兩點小蜘蛛感染。測試的昆蟲種類包括：

AW	南方臂蟲	亞熱帶黏蟲
BB	墨西哥豆甲蟲	墨西哥豆瓢蟲
MTA	兩點小蜘蛛	蜘蛛(Teranychus uricate)

於噴灑後24-48小時以目視觀察記錄控制百分比。

當以每公頃300克的化合物測試抗南方臂蟲的結果，化合物1.11，1.102及1.105可提供90%或是更佳的控制；當以每公頃150克的化合物測試時，化合物1.14，2.19，2.28，3.28A可提供90%或是更佳的控制。

當以每公頃300克的化合物測試抗墨西哥豆甲蟲的結果，化合物1.11，1.22A，1.22B，1.27，1.61A，1.67，1.94，1.102，1.105，1.116，1.116A，2.11，3.11可提供90%或是更佳的控制；當以每公頃150克的化合物測試時，化合物1.14，2.11A，2.12A，2.19，2.24，2.25A，2.25B，2.27，2.28，2.34，3.11A，3.11B，3.12A，3.14A，3.19A，3.24A，3.25A，3.26A，3.27，3.28A，3.33A，3.34A，11.02A，12.02A，11.50A及11.98A可提供90%或是更佳的控制。

當以每公頃300克的化合物測試抗兩點小蜘蛛的結果，

五、發明說明 (137)

化合物 1.11, 1.22A, 1.27, 1.61A, 1.61B, 1.67, 1.94, 1.102, 1.105, 1.116及1.116A可提供90%或是更佳的控制；當以每公頃150克的化合物測試時，化合物 1.14, 2.12A, 2.14A, 2.19, 2.20A, 2.22A, 2.23A, 2.24, 2.26A, 2.27, 2.28, 2.34, 3.12A, 3.14A, 3.19A, 3.20A, 3.23A, 3.26A, 3.27, 3.28A, 3.33A, 3.34及11.50A可提供90%或是更佳的控制。

本發明的組合物及化合物可直接用在欲保護的區域，例如，被昆蟲感染的經濟作物區或是欲保護使不受感染的植物。具有感染性的昆蟲包括鱗翅目，鞘翅目，雙翅目，繭翅目，膜翅目，異翅亞目，同翅目，直翅目，及蜉蝣目。該化合物及組合物可做為接觸式或是系統式的殺蟲劑。本發明化合物使用在昆蟲棲息地的速率是每公頃0.0005至10公斤，較佳是每公頃0.05至5公斤，且最佳是每公頃0.1至1公斤。

在執行本發明方法時，可將活性化合物施用到土壤或是葉片上，其可被植物吸收，傳遞到植物的其他部位，最後被害蟲食入或是藉著食用植物的部位而使昆蟲食入。這項方法被稱為系統式的應用。另外，該活性化合物可直接用在土壤上，並且因此與昆蟲或是要控制的害蟲接觸。該方法被稱為土壤應用法。另外，該活性化合物可被用在葉片上，而使得以葉片為食的昆蟲或是害蟲不接觸該植物。

根據本發明的組合物及調劑尚可包括已知的殺害蟲化合物。這可擴展該製備的活性範圍，而且可引起協同作用。

五、發明說明 (138)

目前已知的適當殺昆蟲劑包括美國專利第 5,075,471 中所列，特別是第 14 及 15 欄。

本發明化合物可以組合物或是調劑的方式使用。組合物及調劑的製備範例可參見美國化學學會期刊“殺害蟲調劑研究”，(1969)，化學系列進階 No.86，由 Wade Van Valkenburg 書寫；以及 Marcel Dekker 公司出版的“殺害蟲調劑”，(1973)，由 Wade Van Valkenburg 編輯。在上述的組合物及調劑中，該活性成份與傳統的惰性農藝上可接受的（如，與植物相容的及/或對殺害蟲上惰性的）的殺害蟲劑稀釋或是延展劑，如固體載體材料或是液體載體材料，以傳統的殺害蟲劑組合物或是調劑方式使用。“農藝上可接受的載體”代表可用來溶解，分散或是擴散組合物中的活性成份，但不傷害活性成份有效性之物料，同時對土壤、設備、所要的植物、或是農業環境不具任何的傷害。若有需要的話，可添加佐劑如，界面活性劑，安定劑，抑泡劑及抑漂移劑。

根據本發明的組合物及調劑範例包括，水性溶液及分散液，油性溶液及油性分散液，糊狀液，煙塵粉末，可濕性粉末，可乳化濃縮液，可流動液，顆粒，餌，可倒轉浮化液，噴灑組合物及燒燃的蠟燭。可濕性粉末，糊狀液，可流動液，及可乳化濃縮液均為濃縮性的製備，其於使用前或是使用中再以水稀釋。這些調劑中，將化合物以液體或是固體載體延展，若有需要的話，再加入適當的界面活性劑。餌是通常包括食物或是其他吸引昆蟲的物料，其中至

（請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁）

裝

訂

五、發明說明 (139)

少包括一種本發明的化合物。

一般需要添加佐劑，特別是葉片噴灑調劑，如濕潤劑，散佈劑，分散劑，增厚劑，吸附劑以及根據農業實行上的相似者。常用的佐劑以及常討論的佐劑可在多種參考文獻中發現，如 John W. McCutcheon，公司出版的“清潔劑及乳化劑年誌”。

本發明的活性化合物可單獨使用或是以混合物方式使用，如與固體及/或液體分散載體，及/或已知的相容活性試劑使用，特別是植物的保護劑，其他的殺昆蟲劑，殺蜘蛛劑，殺線蟲劑，殺真菌劑，殺細菌劑，殺嚙齒類劑，除草劑，肥料，生長調節劑，協同劑。

在本發明的組合物中，該活性化合物的存在量是約為 0.0001(1:999,999)-99(99:1)%重量比。適合用來儲存或是運送的組合物，其中活性成份的量較佳地是介於約 0.5(1:199)-90(9:1)%重量比，較佳是介於 1(1:99)-75(3:1)%重量比的混合物。適合於直接使用或是於野外使用的組合物通常包括的活性化合物的量是介於約 0.0001(1:999,999)-95(19:1)%，較佳地是介於約 0.0005(1:199,999)-90(9:1)%重量比，且最佳是介於約 0.001(1:99,999)-75(3:1)%重量比的混合物。該組合物可以化合物對載體的比例來陳述。在本發明中，該物料的重量比(活性化合物/載體)可介於 99:1(99%)至 1:4(20%)，較佳地是由 10:1(91%)至 1:3(25%)。

一般而言，本發明的化合物可溶在特定的溶劑，如丙

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

五、發明說明 (140)

酮，甲醇，乙醇，二甲基甲醯胺，吡啶或是二甲基亞砷，同時該溶液可被水稀釋。該溶液的濃度可由約1%至約90%，較佳的範圍是介於約5%至約50%。

製備可乳化濃縮液的方法，可將該化合物溶於適當的有機溶劑中，或是溶劑的混合物，加上乳化試劑以加強化合物在水中的分散性。活性成份可乳化濃縮液中的濃度通常由約10%至約90%，而可在流動乳化濃縮液中，其濃度可高達約75%。

適用於可噴灑的可濕性粉末，其製備方法係將化合物與經過細研的固體混合，如黏土，無機矽酸鹽及碳酸鹽，以及硅，並於該混合物中加入濕潤劑，增厚劑，及/或分散劑。該調劑中的活性組成份濃度通常是介於約20%至約99%，較佳地是由約40%至約75%。典型的可濕性粉末製備法是將50%的式I化合物，45%的合成沈澱的水合二氧化矽，及5%的木質磺酸鈉加以混合。高嶺土型態(Barden)的製備是將合成沈澱的水合二氧化矽放置在可濕性粉末上，另外可將25%的二氧化矽以合成的矽鋁酸鈉取代。

煙塵的製備是將式I化合物，或是其鏡像物，鹽及其錯化物與經細研的惰性固體，其可是有機性或是無機性相混合。適用於本目的之物料包括植物麵粉、硅、矽酸鹽、碳酸鹽及黏土。一種製備煙塵的傳統方法是將可濕性粉末以經細研的載體稀釋。包含由約20%至約80%活性成份的煙塵濃縮物是常見的，並可經稀釋後為由約1%至約10%的使用濃度。

五、發明說明 (141)

可利用常用的方法將殺昆蟲劑噴灑，如傳統的高加侖水流噴灑器，低加侖噴灑器，超低體積噴灑，氣爆式噴灑，空氣噴灑，及煙塵。

本發明同時包括殺死，克服或是控制害蟲的方法，其中包括使該害蟲接觸可克服的，或是具毒性的劑量(如，殺害蟲上的有效劑量)之至少一種僅有本發明之活性化合物，或是包括上述的載體(組合物或是調劑)。在文中及發明範圍內提及的名詞“接觸”代表至少對一種(a)害蟲及(b)其相應的棲息地(即，欲保護的區域，如，生長的農作物或是農作物生長的地區)單獨施用本發明之活性化合物，或是其組合物或是調劑。

除了前述的組成份，根據本發明之製備可包括其製備中常使用的物料。例如，加入潤滑劑，如硬脂酸鈣或是硬脂酸鎂，至可濕性粉末中，或是要製成顆粒的混合物中。另外，尚可加入“吸附劑”，如聚乙烯醇-纖維素衍生物或是其他的顆粒性物料，如乳蛋白，以加強殺害蟲劑附著於欲保護的表面。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

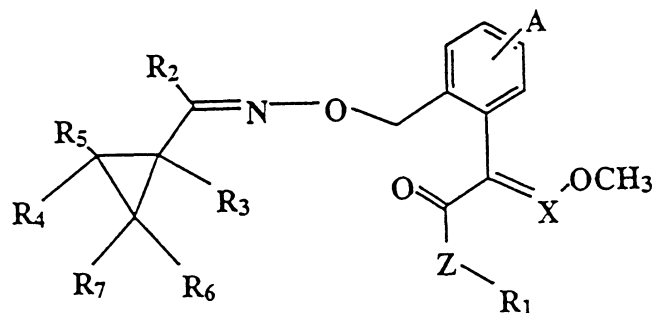
裝

訂

四、中文發明摘要(發明之名稱：

芳基及雜芳環丙基肟醚及其作為殺菌劑及殺蟲劑之用途)

本發明係關於如下式之具有殺菌及殺昆蟲性質的化合物

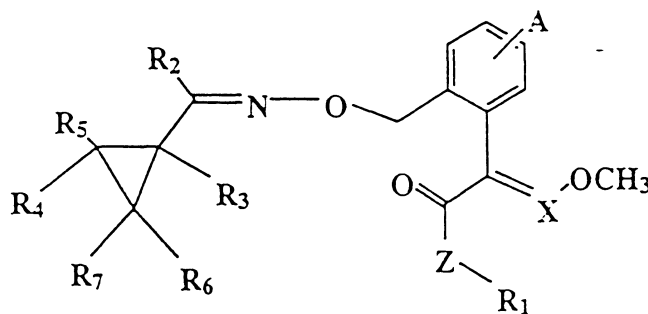


其中X是N或是CH；Z是O，S或是NR₈；A是氫，鹵基，氰基，(C₁-C₁₂)烷基，或是(C₁-C₁₂)烷氧基；R₁及R₈分別是氫及(C₁-C₄)烷基；R₂是氫，(C₁-C₁₂)烷基，鹵基(C₁-C₁₂)烷基，(C₃-C₇)環烷基，鹵基(C₃-C₇)環烷基，(C₂-C₈)烯基，

英文發明摘要(發明之名稱：

ARYL AND HETEROARYLCYCLOPROPYL
OXIME ETHERS AND THEIR USE AS
FUNGICIDES AND INSECTICIDES)

Compounds with fungicidal and insecticidal properties having formula



wherein X is N or CH; Z is O, S or NR₈; A is hydrogen, halo, cyano, (C₁-C₁₂)alkyl, or (C₁-C₁₂)alkoxy; R₁ and R₈ are independently hydrogen or (C₁-C₄)alkyl; R₂ is hydrogen, (C₁-C₁₂)alkyl, halo(C₁-C₁₂)alkyl, (C₃-C₇)cycloalkyl, halo(C₃-C₇)cycloalkyl, (C₂-C₈)alkenyl, halo(C₂-C₈)alkenyl, (C₂-C₈)alkynyl, halo(C₂-C₈)alkynyl, aryl, aralkyl, heterocyclic, heterocyclic(C₁-C₄)alkyl or C(R₁₀)=N-OR₉; R₃ is hydrogen, (C₁-C₁₂)alkyl,

四、中文發明摘要(發明之名稱:)

鹵基(C₂-C₈)烯基, (C₂-C₈)炔基, 鹵基(C₂-C₈)炔基, 芳基, 芳烷基, 雜環, 雜環(C₁-C₄)烷基或是C(R₁₀)=N-OR₉; R₃是氫, (C₁-C₁₂)烷基, 鹵基(C₁-C₁₂)烷基, (C₃-C₇)環烷基, 鹵基(C₃-C₇)環烷基, (C₂-C₈)烯基, 鹵基(C₂-C₈)烯基, (C₂-C₈)炔基, 鹵基(C₂-C₈)炔基, 芳基, 芳烷基, 芳基(C₃-C₇)環烷基, 雜環或是雜環(C₁-C₄)烷基; R₄及R₅分別是氫, (C₁-C₁₂)烷基, 鹵基(C₁-C₁₂)烷基, (C₃-C₇)環烷基, 鹵基(C₃-C₇)環烷基, (C₂-C₈)烯基, 鹵基(C₂-C₈)烯基, (C₂-C₈)炔基, 鹵基(C₂-C₈)炔基, 鹵基, 氰基, (C₁-C₄)烷氧基羰基, 芳基, 芳烷基, 芳基(C₃-C₇)環烷基, 雜環或是雜環(C₁-C₄)烷基; R₆是氫, (C₁-C₁₂)烷基, 鹵基(C₁-C₁₂)烷基, (C₃-C₇)環烷基, 鹵基(C₃-C₇)環烷基, (C₂-C₈)烯基, 鹵基(C₂-C₈)烯基, (C₂-C₈)炔基

英文發明摘要(發明之名稱:)

halo(C₁-C₁₂)alkyl, (C₃-C₇)cycloalkyl, halo(C₃-C₇)cycloalkyl, (C₂-C₈)alkenyl, halo(C₂-C₈)alkenyl, (C₂-C₈)alkynyl, halo(C₂-C₈)alkynyl, aryl, aralkyl, aryl(C₃-C₇)cycloalkyl, heterocyclic or heterocyclic(C₁-C₄)alkyl; R₄ and R₅ are independently hydrogen, (C₁-C₁₂)alkyl, halo(C₁-C₁₂)alkyl, (C₃-C₇)cycloalkyl, halo(C₃-C₇)cycloalkyl, (C₂-C₈)alkenyl, halo(C₂-C₈)alkenyl, (C₂-C₈)alkynyl, halo(C₂-C₈)alkynyl, halo, cyano, (C₁-C₄)alkoxycarbonyl, aryl, aralkyl, aryl(C₃-C₇)cycloalkyl, heterocyclic or heterocyclic(C₁-C₄)alkyl; R₆ is hydrogen, (C₁-C₁₂)alkyl, halo(C₁-C₁₂)alkyl, (C₃-C₇)cycloalkyl, halo(C₃-C₇)cycloalkyl, (C₂-C₈)alkenyl, halo(C₂-C₈)alkenyl, (C₂-C₈)alkynyl, halo(C₂-C₈)alkynyl, halo, cyano, (C₁-C₄)alkoxycarbonyl, aryl, aralkyl, aryl(C₃-C₇)cycloalkyl, heterocyclic or heterocyclic(C₁-C₄)alkyl; R₇ is aryl, aralkyl,

四、中文發明摘要（發明之名稱：

)

基，鹵基(C₂-C₈)炔基，鹵基，氰基，(C₁-C₄)烷氧基羰基，芳基，芳烷基，芳基(C₃-C₇)環烷基，雜環或是雜環(C₁-C₄)烷基；R₇是芳基，芳烷基，雜環或是雜環(C₁-C₄)烷基；R₉是氫，(C₁-C₁₂)烷基，鹵基(C₁-C₁₂)烷基，(C₂-C₈)烯基，鹵基(C₂-C₈)烯基，(C₂-C₈)炔基，鹵基(C₂-C₈)炔基，(C₁-C₄)烷氧基羰基，(C₁-C₄)烷氧基羰基，芳基或是芳烷基；且R₁₀是氫，(C₁-C₁₂)烷基，鹵基(C₁-C₁₂)烷基，(C₃-C₇)環烷基，鹵基(C₃-C₇)環烷基，(C₂-C₈)烯基，鹵基(C₂-C₈)烯基，(C₂-C₈)炔基，鹵基(C₂-C₈)炔基，芳基，芳烷基，雜環，或是雜環(C₁-C₄)烷基。

=

英文發明摘要（發明之名稱：

)

heterocyclic or heterocyclic(C₁-C₄)alkyl; R₉ is hydrogen, (C₁-C₁₂)alkyl, halo(C₁-C₁₂)alkyl, (C₂-C₈)alkenyl, halo(C₂-C₈)alkenyl, (C₂-C₈)alkynyl, halo(C₂-C₈)alkynyl, (C₁-C₄)alkylcarbonyl, (C₁-C₄)alkoxycarbonyl, aryl, or aralkyl; and R₁₀ is hydrogen, (C₁-C₁₂)alkyl, halo(C₁-C₁₂)alkyl, (C₃-C₇)cycloalkyl, halo(C₃-C₇)cycloalkyl, (C₂-C₈)alkenyl, halo(C₂-C₈)alkenyl, (C₂-C₈)alkynyl, halo(C₂-C₈)alkynyl, aryl, aralkyl, heterocyclic, or heterocyclic(C₁-C₄)alkyl.

=

公告本

92年1月29日 修正
補充

申請日期	89.1.13
案 號	89100482
類 別	C07C ^{51/60} , A01N ^{37/60}

A4

C4

中文說明書修正頁(92年1月29日)

(以上各欄由本局填註)

發明專利說明書 548258

一、發明名稱	中 文	芳基及雜芳環丙基肼醚及其作為殺黴菌劑及殺蟲劑之用途
	英 文	ARYL AND HETEROARYLCYCLOPROPYL OXIME ETHERS AND THEIR USE AS FUNGICIDES AND INSECTICIDES
二、發明創作人	姓 名	1.羅那德 羅斯 2.戴恩 維龍 奈格耶 3.史帝芬 豪華德 沙巴
	國 籍	1.-3.均美國
	住、居所	1.美國賓州傑米森市傑利可路2198號 2.美國賓州費勒達費亞市史戴登大道7600號第7D號公寓 3.美國賓州侯莎曼市亞瑟史脫克路44號
三、申請人	姓 名 (名稱)	美商·陶氏農業科學公司
	國 籍	美 國
	住、居所 (事務所)	美國印地安納州印地安納波立斯·茲艾斯維爾路9330號
	代 表 人 姓 名	肯尼斯 L. 羅特史屈爾

裝

訂

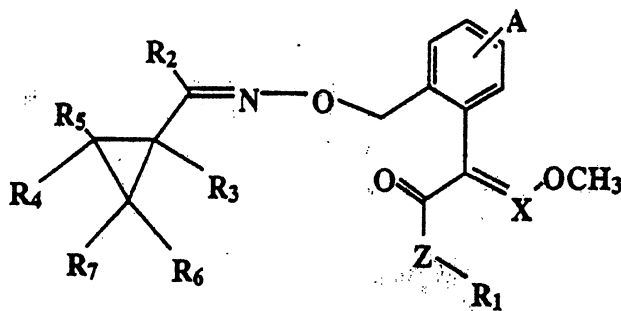
線

92-5-26 補正

六、申請專利範圍

第89100482號專利申請案申請專利範圍修正本 92年5月26日

1. 一種如下式之化合物：

其中X是N或是CH；Z是O，S或是NR₈；A係選自下述基團，包括氫，鹵基，氰基，(C₁-C₁₂)烷基，及(C₁-C₁₂)烷氧基；R₁及R₈係分別選自下述基團，包括氫及(C₁-C₄)烷基；R₂係選自下述基團，包括氫，(C₁-C₁₂)烷基，鹵基(C₁-C₁₂)烷基，(C₃-C₇)環烷基，鹵基(C₃-C₇)環烷基，(C₂-C₈)烯基，鹵基(C₂-C₈)烯基，(C₂-C₈)炔基，鹵基(C₂-C₈)炔基，芳基，芳烷基，雜環，雜環(C₁-C₄)烷基及C(R₁₀)=N-OR₉；R₃係氫；R₄及R₅係分別選自下述基團，包括氫，(C₁-C₁₂)烷基，鹵基(C₁-C₁₂)烷基，(C₃-C₇)環烷基，鹵基(C₃-C₇)環烷基，(C₂-C₈)烯基，鹵基(C₂-C₈)烯基，(C₂-C₈)炔基，鹵基(C₂-C₈)炔基，鹵基，氰基，(C₁-C₄)烷氧基羰基，芳基，芳烷基，芳基(C₃-C₇)環烷基，芳基(C₂-C₈)烯基，雜環或是雜環(C₁-C₄)烷基；

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

六、申請專利範圍

R_6 係選自下述基團，包括氫， (C_1-C_{12}) 烷基，鹵基
 (C_1-C_{12}) 烷基， (C_3-C_7) 環烷基，鹵基 (C_3-C_7) 環烷基，
 (C_2-C_8) 烯基，鹵基 (C_2-C_8) 烯基， (C_2-C_8) 炔基，鹵基 (C_2-C_8)
 炔基，鹵基，氰基， (C_1-C_4) 烷氧基羰基，芳基，芳烷基
 ，芳基 (C_3-C_7) 環烷基，芳基 (C_2-C_8) 烯基，雜環及雜環
 (C_1-C_4) 烷基；

R_7 係選自下述基團，包括芳基，芳烷基，雜環及雜
 環 (C_1-C_4) 烷基；

R_9 係選自下述基團，包括氫， (C_1-C_{12}) 烷基，鹵基
 (C_1-C_{12}) 烷基， (C_2-C_8) 烯基，鹵基 (C_2-C_8) 烯基， (C_2-C_8)
 炔基，鹵基 (C_2-C_8) 炔基， (C_1-C_4) 烷基羰基， (C_1-C_4) 烷
 氧基羰基，芳基及芳烷基；

R_{10} 係選自下述基團，包括氫， (C_1-C_{12}) 烷基，鹵基
 (C_1-C_{12}) 烷基， (C_3-C_7) 環烷基，鹵基 (C_3-C_7) 環烷基，
 (C_2-C_8) 烯基，鹵基 (C_2-C_8) 烯基， (C_2-C_8) 炔基，鹵基 (C_2-C_8)
 炔基，芳基，芳烷基，雜環及雜環 (C_1-C_4) 烷基；

但是，需滿足下列條件：

芳基係從由苯基、萘基，以及經取代之苯基或萘基
 所構成之組群中選出，該經取代之苯基或萘基可經至多
 三個獨立地從鹵素、氰基、三鹵甲基、苯基、苯氧基、
 (C_1-C_4) 烷基、 (C_1-C_4) 烷氧基、 (C_1-C_4) 烷基硫基、 (C_1-C_4)
 烷基亞砷、鹵 (C_1-C_4) 烷基及鹵 (C_1-C_4) 烷氧基所構成之
 組群中選出的取代基所取代；

雜環係從由經取代或未取代之含有一個、二個或三

六、申請專利範圍

個獨立地從氧、氮及硫中選出之雜原子的6員不飽和環、含有包括一個從氧、氮及硫中選出之雜原子之至多10原子的雙環不飽和環系，以及含有一個、二個或三個獨立地從氧、氮及硫中選出之雜原子的5員不飽和環所構成之組群中選出；且

芳烷基係一具有支鏈或直鏈(C₁-C₁₀)烷基的基團，其以具有上述定義之芳基作為從經取代之苯甲基、苯乙基、苯丙基及苯丁基所構成之組群中選出之芳烷基部分的最終部位；

以及其鏡像異構物，立體異構物，及其於農藝上可接受的載體。

2. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中X是CH，Z是O，R₂是(C₁-C₁₂)烷基，及R₃是H。
3. 如申請專利範圍第2項之化合物，其中R₇係選自下述基團，包括苯基，2-氯苯基，2-氟苯基，2-三氟甲基苯基，3-氯苯基，3-氟苯基，3-三氟甲基苯基，4-氯苯基，4-氟苯基，4-三氟甲基苯基及2,4-二氯苯基。
4. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中X是N，Z是O或NH，R₂是(C₁-C₁₂)烷基，及R₃是H。
5. 如申請專利範圍第4項之化合物，其中R₇係選自下述基團，包括苯基，2-氯苯基，2-氟苯基，2-三氟甲基苯基，3-氯苯基，3-氟苯基，3-三氟甲基苯基，4-氯苯基，4-氟苯基，4-三氟甲基苯基及2,4-二氯苯基。
6. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中的化合物是N-甲

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝

訂

線

六、申請專利範圍

基-2-[2-((((反-1-(2-(3'-三氟甲基苯基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙醯胺。

7. 如申請專利範圍第1項之化合物，其中的化合物是N-甲基-2-[2-((((反-1-(2-(4'-氯苯基)環丙基)亞乙基)胺基)氧基)甲基)苯基]-2-甲氧基亞胺基乙醯胺。
8. 一種控制植物病原性真菌之殺真菌組合物，其包括於農藝上可接受的載劑及如申請專利範圍第1項之化合物，其中該載劑對化合物的比率是介於99：1至1：4。
9. 一種控制植物病原性真菌的方法，其中包括使用如申請專利範圍第1項之化合物至需要控制的區域，比率是由每公頃0.005公斤至50公斤。
10. 一種控制昆蟲的方法，其中包括以每公頃0.005公斤至10公斤的比率將如申請專利範圍第1項之化合物噴灑至昆蟲的棲息地。

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

裝
訂
線