



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201011000 A1

(43)公開日：中華民國 99 (2010) 年 03 月 16 日

(21)申請案號：098119943

(22)申請日：中華民國 98 (2009) 年 06 月 15 日

(51)Int. Cl.：

*C07D403/04 (2006.01)*

*C07D401/14 (2006.01)*

*C07D403/14 (2006.01)*

*C07D405/12 (2006.01)*

*C07D409/12 (2006.01)*

*A01N43/56 (2006.01)*

*A01N43/54 (2006.01)*

*A01N43/60 (2006.01)*

*A01P13/00 (2006.01)*

(30)優先權：2008/06/17 歐洲專利局 08010947.3

(71)申請人：拜耳農業科學股份有限公司(德國) BAYER CROPSCIENCE AG (DE)

德國

(72)發明人：賈可比 哈洛德 JAKOBI, HARALD (DE)；瑪泰勒提 艾瑞納 MARTELLETTI, ARIANNA (CH)；泰比斯 喬格 TIEBES, JOERG (DE)；迪特俊 珍 DITTGEN, JAN (DE)；菲克特 戴特 FEUCHT, DIETER (DE)；豪瑟哈恩 艾索德 HAEUSER-HAHN, ISOLDE (DE)；凱恩 海茲 KEHNE, HEINZ (DE)；羅辛格 克里斯多佛 ROSINGER, CHRISTOPHER (GB)

(74)代理人：林志剛

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：13 項 圖式數：0 共 361 頁

(54)名稱

經取代的 1-(二嗪基)吡唑-4-基乙酸類、彼之製法及彼作為除草劑和植物生長調節劑之用途  
SUBSTITUTED 1-(DIAZINYL)PYRAZOL-4-YLACETIC ACIDS, PROCESSES FOR THEIR PREPARATION AND THEIR USE AS HERBICIDES AND PLANT GROWTH REGULATORS

(57)摘要

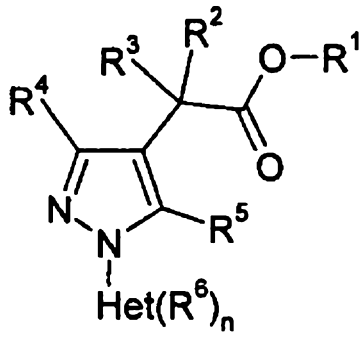
本發明係有關如下通式(I)所示之 1-(3-二嗪基)吡唑-4-基乙酸衍生物及其鹽類：



(I)

其中 Het、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup> 和 n 是如申請專利範圍第 1 項所定義。化合物(I)和其鹽類適合作為除草劑和植物生長調節劑，特別是作為選擇性防治有用植物作物中之有害植物的除草劑，且其可利用申請專利範圍第 8 項之方法製造。

式 I



(I)



(19) 中華民國智慧財產局

(12) 發明說明書公開本

(11) 公開編號：TW 201011000 A1

(43) 公開日：中華民國 99 (2010) 年 03 月 16 日

(21) 申請案號：098119943

(22) 申請日：中華民國 98 (2009) 年 06 月 15 日

(51) Int. Cl. :

*C07D403/04 (2006.01)*

*C07D401/14 (2006.01)*

*C07D403/14 (2006.01)*

*C07D405/12 (2006.01)*

*C07D409/12 (2006.01)*

*A01N43/56 (2006.01)*

*A01N43/54 (2006.01)*

*A01N43/60 (2006.01)*

*A01P13/00 (2006.01)*

(30) 優先權：2008/06/17 歐洲專利局 08010947.3

(71) 申請人：拜耳農業科學股份有限公司 (德國) BAYER CROPSCIENCE AG (DE)

德國

(72) 發明人：賈可比 哈洛德 JAKOBI, HARALD (DE)；瑪泰勒提 艾瑞納 MARTELLETTI, ARIANNA (CH)；泰比斯 喬格 TIEBES, JOERG (DE)；迪特俊 珍 DITTGEN, JAN (DE)；菲克特 戴特 FEUCHT, DIETER (DE)；豪瑟哈恩 艾索德 HAEUSER-HAHN, ISOLDE (DE)；凱恩 海茲 KEHNE, HEINZ (DE)；羅辛格 克里斯多佛 ROSINGER, CHRISTOPHER (GB)

(74) 代理人：林志剛

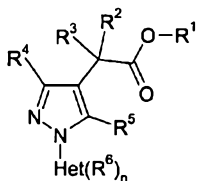
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：13 項 圖式數：0 共 361 頁

(54) 名稱

經取代的 1 - (二嗪基) 吡唑 - 4 - 基乙酸類、彼之製法及彼作為除草劑和植物生長調節劑之用途  
SUBSTITUTED 1-(DIAZINYL)PYRAZOL-4-YLACETIC ACIDS, PROCESSES FOR THEIR PREPARATION AND THEIR USE AS HERBICIDES AND PLANT GROWTH REGULATORS

(57) 摘要

本發明係有關如下通式(I)所示之 1-(3-二嗪基)吡唑-4-基乙酸衍生物及其鹽類：



(I)

其中 Het、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup> 和 n 是如申請專利範圍第 1 項所定義。化合物(I)和其鹽類適合作為除草劑和植物生長調節劑，特別是作為選擇性防治有用植物作物中之有害植物的除草劑，且其可利用申請專利範圍第 8 項之方法製造。

## 六、發明說明：

### 【發明所屬之技術領域】

本發明係有關除草劑和植物生長調節劑之技術領域，例如用於防治有用植物中之寬葉雜草和雜草的除草劑，或用於影響作物的生長之植物生長調節劑。

### 【先前技術】

目前已知用於選擇性防治有用植物中之有害植物的作物保護劑或用於防治非所欲的植物之活性化合物在應用時有時具有缺點：(a) 其對特定的有害植物不具有除草活性或是不足，(b) 可為活性化合物防治的有害植物之範圍不夠寬廣，(c) 其於有用植物中的選擇性太低或者其會產生不利的毒物學量變曲線。可用作為許多有用植物的植物生長調節劑之其他活性化合物對其他有用植物造成非所欲的收成率減低或與作物不相容，或只能在狹窄的施用比率範圍。由於難以得到前驅物和試劑或其化學安定性不足，其他已知的活性化合物不能以工業規模經濟地製造。在其他活性化合物的情況，其活性高度地決定於環境條件，例如氣候和土壤條件。

除草性 3-(雜)芳基-4-[(雜)芳基羰基]吡啶化合物係揭示於 EP-A-0822187 及其中引用的文獻。

US 4146721 揭示吡啶基乙酸類作為止痛劑、退熱劑和消炎劑；然而，用作為農藥(pesticides)，特別是除草劑，的用途目前仍未被揭示。

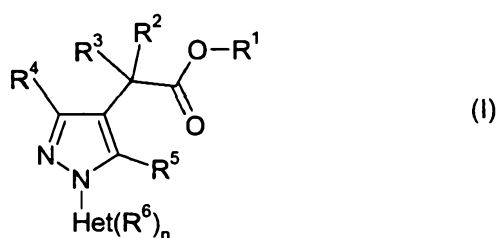
US 4,095,025 描述具藥學(例如消炎)用途之 1,3-二芳基吡唑-4-丙烯酸和其衍生物。

WO 2004/089931 描述在吡唑的第 1 位置之氮原子上具有任意經取代的苯基或吡啶-3-基之經取代的吡唑，其係用於治療和預防可藉由化合物與 5 HT 受體的結合而調節之疾病。

基於上述的理由，仍然需要有替代之高度活性的除草劑以供選擇性應用於植物作物和用於非耕作土地。亦希望可製造出適當的話可有利地用作為除草劑或植物生長調節劑之其他的化學活性化合物。

### 【發明內容】

本發明提供式(I)所示化合物或其鹽



其中

Het 是具有 2 個雜原子作為環原子之六員雜芳族基團，其中該環中的雜原子是氮原子且環中至少一個氮原子是位於連結至吡唑基團的環碳原子之 1,3-位置，

R<sup>1</sup> 是氫或可水解的基團，較佳是氫或任意經取代的烴基或任意經取代的雜環基團，其中該 2 個最後提及的含碳基團分別具有(含取代基) 1 至 30 個碳原子，較佳

是 1 至 24 個碳原子，特別是 1 至 20 個碳原子，或式  $\text{SiR}^a\text{R}^b\text{R}^c$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^b$  或  $-\text{N}=\text{CR}^c\text{R}^d$  所示的基團，

其中該 3 個最後提及的化式中之各個基團  $\text{R}^a$ 、 $\text{R}^b$ 、 $\text{R}^c$  和  $\text{R}^d$  彼此各自獨立地是氫或任意經取代的烴基，或  $\text{R}^a$  和  $\text{R}^b$  與氮原子一起為 3-至 9-員雜環，而其除了該氮原子以外可亦含有一或二個選自 N、O 和 S 之其他的環雜原子，且其是未經取代或經取代的，或  $\text{R}^c$  和  $\text{R}^d$  與碳原子一起為 3-至 9-員碳環基團或可含有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之雜環基團，其中該碳環或雜環基團是未經取代或經取代的，

其中該基團  $\text{R}^a$ 、 $\text{R}^b$ 、 $\text{R}^c$  和  $\text{R}^d$  分別具有(含取代基)至多 30 個碳原子，較佳是至多 24 個碳原子，特別是至多 20 個碳原子，

$\text{R}^2$  是氫、鹵素、或  $(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -烷基(未經取代或經一或多個選自鹵素、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷硫基和  $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -鹵烷氧基之基團所取代)，

$\text{R}^3$  是氫、鹵素、或  $(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -烷基(未經取代或經一或多個選自鹵素、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷硫基和  $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -鹵烷氧基之基團所取代)，或

$\text{R}^2$  和  $\text{R}^3$  與所相連的碳原子一起為具有 3 至 6 個碳原子之飽和或部份未飽和的碳環，而其是未經取代或經一或多個選自鹵素和  $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷基之基團所取代，及

$\text{R}^4$  是氫、鹵素、氰基、 $(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -烷基、 $(\text{C}_2-\text{C}_6)$ -烯基或

(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基，其中該 3 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自鹵素、氰基、羥基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基和任意經鹵素、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基取代的(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-環烷基之基團所取代，或較佳是未經取代或經一或多個選自鹵素、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基和任意經鹵素、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基取代的(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-環烷基之基團所取代，或

(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-環烷基、(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環烯基或(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環炔基，其中該 3 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基之基團所取代，或

苯基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素、氰基、硝基、羧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷醯基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基]羰基和[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基]羰基之基團所取代，或

(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷醯基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基和任意經鹵素、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基取代的(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基之基團所取代，或

[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基]羰基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基和任意經鹵素、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基取代的(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基之基團所取代，或

[(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-環烷氧基]羰基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基之基團所取代，

R<sup>5</sup> 是芳基，其是未經取代或經取代的，且具有(含取代基) 6 至 30 個碳原子，較佳是 6 至 24 個碳原子，特別是 6 至 20 個碳原子，或

具有 1 至 4 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之雜芳族基團，其是未經取代或經取代的，且具有(含取代基) 1 至 30 個碳原子，較佳是 1 至 24 個碳原子，特別是 1 至 20 個碳原子，及

(R<sup>6</sup>)<sub>n</sub> 是 n 個取代基 R<sup>6</sup>，其中當 n = 1 時之 R<sup>6</sup> 或當 n

是大於 1 時之各個取代基  $R^6$  彼此各自獨立地為下列基團：鹵素、羥基、胺基、硝基、羧基、氰基、胺甲醯基、 $(C_1-C_6)$ -烷基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基、 $(C_1-C_4)$ -烷基、單-或二- $[(C_1-C_4)$ -烷基]胺基、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_2-C_6)$ -烯基、 $(C_2-C_6)$ -鹵烯基、 $(C_2-C_6)$ -炔基、 $(C_2-C_6)$ -鹵炔基、 $(C_1-C_6)$ -烷氧基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_6)$ -烷硫基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷硫基、 $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_6)$ -鹵烷氧基]羰基、 $(C_1-C_6)$ -烷醯基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷醯基、單-或二- $[(C_1-C_4)$ -烷基]胺羰基、單-或二- $[(C_1-C_6)$ -醯基]胺基、單-或二- $[(C_1-C_4)$ -烷基]胺基、 $N-[(C_1-C_6)$ -醯基]- $N-[(C_1-C_6)$ -烷基]胺基、 $(C_1-C_6)$ -烷亞磺醯基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷亞磺醯基、 $(C_1-C_6)$ -烷磺醯基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷磺醯基、 $(C_3-C_9)$ -環烷基或 $(C_5-C_9)$ -環烯基，其中該 2 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自鹵素、 $(C_1-C_4)$ -烷基和 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基之基團所取代，及

$n$  是 0、1、2 或 3。

藉由將適合的無機或有機酸，例如  $HCl$ 、 $HBr$ 、 $H_2SO_4$  或  $HNO_3$  以及草酸或磺酸，加至鹼性基團，例如胺基或烷基胺基，式(I)所示化合物可形成鹽。以去質子形態存在之適合的取代基，例如，磺酸或羧酸，可與本身中可被質子化的基團(例如胺基)形成內鹽。亦可藉由以農業上適合的

陽離子取代適合的取代基(例如磺酸或羧酸)的氫而形成鹽。所述的鹽是例如金屬鹽，特別是鹼金屬鹽或鹼土金屬鹽，特別是鈉鹽和鉀鹽、或是銨鹽、與有機胺形成的鹽、或四級銨鹽。

於式(I)和所有後續的化式中，所用的是特別具有下列所述定義之化學基團的用語。

可水解的基團(參見  $R^1$  的定義)是在應用的條件下會被水解的基團，例如即使於噴灑的液體中或特別是在植物的生理條件下會被水解之基團，其中具有羧酸酯基團  $-CO-OR^1$  ( $R^1$  不是氫)之式(I)所示化合物被水解成具有羧酸基團  $-CO-OH$  的式(I)所示化合物(即化合物(I)，其中  $R^1 = H$ )。明確地說，可水解的基團之定義亦包含  $R^1 =$  烴基或雜環基之基團基團，而該 2 個最後提及的基團係未經取代或經取代，即使其中部份基團是相當緩慢地水解。

烴基是以元素碳和氫為底的脂族、環脂族或芳族單環，或在任意經取代的烴基的情況，亦是雙環或多環有機基團，包含，例如，烷基、烯基、炔基、環烷基、環烯基、芳基、苯基、萘基、茛滿基、茛基，等；此對應地應用於複合定義的烴基，例如烴氧基(hydrocarbonoxy)基團或經由雜原子基團連結之其他烴基。

除非更詳細定義，烴基較佳是具有 1 至 20 個碳原子，更佳是 1 至 16 個碳原子，特別是 1 至 12 個碳原子。

烴基，特別是烷基、烷氧基、鹵烷基、鹵烷氧基、烷基胺基和烷硫基，以及對應之未飽和和/或經取代的基團

，在各個情況中，其碳鏈可為直鏈或支鏈。

“(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基”乙辭是具有 1 至 4 個碳原子的烷基之簡易表示法，即涵蓋甲基、乙基、1-丙基、2-丙基、1-丁基、2-丁基、2-甲基丙基或第三丁基。具有較大指定範圍的碳原子之一般烷基，例如“(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基”，對應地亦包含具有較大碳原子數的直鏈或支鏈烷基，即，根據實例，亦包含具有 5 和 6 個碳原子的烷基。

除非特別指明，較佳的是具有低碳數骨架者，例如具有 1 至 6 個碳原子，或在未飽和基團的情況具有 2 至 6 個碳原子，在烴基(例如烷基、烯基和炔基)的情況，包含於組合基團中者。烷基，包含於組合定義的基團(例如烷氧基、鹵烷基等)中者，是例如甲基、乙基、正-或異丙基、正丁基、異丁基、第三丁基或 2-丁基、戊基類、己基類(例如正己基、異己基和 1,3-二甲基丁基)、庚基類(例如正庚基、1-甲基己基和 1,4-二甲基戊基)；烯基和炔基係定義為對應於烷基之可能的未飽和基團；烯基是例如乙烯基、烯丙基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、2-丁烯基、戊烯基、2-甲基戊烯基或己烯基，較佳是烯丙基、1-甲基丙-2-烯-1-基、2-甲基丙-2-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、丁-3-烯-1-基、1-甲基丁-3-烯-1-基或 1-甲基丁-2-烯-1-基。

烯基亦特別包含具有多於一個雙鍵的直鏈或支鏈烴基，例如 1,3-丁二烯基和 1,4-戊二烯基，以及具有一或多個連續的雙鍵之丙二烯基或多烯基(cumulenyl)基團，例如丙二烯基(1,2-丙二烯基)、1,2-丁二烯基和 1,2,3-戊三烯基。

炔基是，例如炔丙基、丁-2-炔-1-基、丁-3-炔-1-基、1-甲基丁-3-炔-1-基。

炔基亦包含，特別是，具有多於一個參鍵或者具有一或多個參鍵和一或多個雙鍵的直鏈或支鏈烴基，例如 1,3-丁二炔基或 3-戊烯-1-炔-1-基。

3-至 9-員碳環是 (C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-環烷基或 (C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環烯基。

(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-環烷基是較佳具有 3-9 個碳原子之飽和碳環系統，例如環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、環辛基或環壬基。在經取代的環烷基的情況，包含具有取代基的環狀系統，其中該取代基可亦藉由一個雙鍵而鍵結至環烷基，例如亞烷基，例如亞甲基。

(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環烯基是具有 5-9 個碳原子之碳環、非芳族、部份未飽和的環系統，例如 1-環丁烯基、2-環丁烯基、1-環戊烯基、2-環戊烯基、3-環戊烯基、或 1-環己烯基、2-環己烯基、3-環己烯基、1,3-環己二烯基或 1,4-環己二烯基在經取代的環烯基的情況，可對應地應用上述經取代的環烷基的定義。

亞烷基，亦例如 (C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-亞烷基的形式，是經由一個雙鍵而鍵結的直鏈或支鏈烷基團，其中鍵結的位置並未固定。在支鏈烷的情況，當然，只有在 2 個氫原子可被該雙鍵取代的位置是可能的；所述之基團是例如 =CH<sub>2</sub>、=CH-CH<sub>3</sub>、=C(CH<sub>3</sub>)-CH<sub>3</sub>、=C(CH<sub>3</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub> 或 =C(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>)-C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>。

鹵素是，例如，氟、氯、溴或碘。鹵烷基、鹵烯基和鹵炔基分別是部份或全部經相同或不同的鹵原子(較佳是

氟、氯和溴，特別是氟和氯)取代之烷基、烯基和炔基，例如單鹵烷基、全鹵烷基、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{CHF}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{F}$ 、 $\text{CF}_3\text{CF}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{FCHCl}$ 、 $\text{CCl}_3$ 、 $\text{CHCl}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ；鹵烷氧基是例如  $\text{OCF}_3$ 、 $\text{OCHF}_2$ 、 $\text{OCH}_2\text{F}$ 、 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{O}$ 、 $\text{OCH}_2\text{CF}_3$  和  $\text{OCH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ ；同樣地亦應用至鹵烯基和其他經鹵素取代的基團。

芳基是單-、雙-或多環芳族系統，例如苯基、萘基、四氫萘基、茛基、茛滿基、並環戊二烯基(pentalenyl)、蒾基等，較佳是苯基。

任意經取代的芳基亦包含多環系統，例如四氫萘基、茛基、茛滿基、蒾基、聯苯基，其中連結點是在芳族系統。

雜環基團(雜環基)含有至少一個雜環(=至少一個碳原子為雜原子所取代之碳環，較佳是為選自 N、O、S、P、B、Si、Se 的雜原子所取代)，其是飽和、未飽和或雜芳族，且其可以是未經取代或經取代的，其中連結點是位於環原子。

除非另外指明，其較佳是雜環中含有一或多個，特別是 1、2 或 3 個雜原子，較佳是選自 N、O、和 S 的雜原子；其較佳是具有 3 至 7 個環原子的脂族雜環基團或具有 5 或 6 環原子的雜芳族基團。所述之雜環基團可，例如，為雜芳族基團或環(雜芳基)，例如單-、雙-或多環芳族系統，其中至少一個環含有一或多個雜原子。

如果該雜環基團或雜環是任意經取代的，其可以稠合

至其他碳環或雜環。較佳的是苯並-稠合的雜環或雜芳族環。

任意經取代的雜環基亦包含多環系統，例如 8-氮雜二環 [3.2.1]辛基或 1-氮雜二環 [2.2.1]庚基。

任意經取代的雜環基亦包含螺環系統，例如 1-氧雜-5-氮雜-螺 [2.3]己基。

較佳的是具有選自 N、O 和 S 的雜原子之雜芳族環，例如五或六員環，例如吡啶基、吡咯基、噻吩基或呋喃基；

另外較佳的是具有 2、3 或 4 個雜原子之對應的雜芳族環，例如嘧啶基、噻嗪基、吡嗪基、三嗪基、四嗪基、噻唑基、噻二唑基、噁唑基、異噁唑基、吡唑基、咪唑基或三唑基或四唑基。

其中，較佳的是具有 1 至 4 個雜原子之雜芳族的五或六員環，例如，1,2,3-三唑基、1,2,4-三唑基、四唑基、異噻唑基、1,2,3-噁二唑基、1,2,4-噁二唑基、1,3,4-噁二唑基、1,2,5-噁二唑基、1,2,3-噻二唑基、1,2,4-噻二唑基、1,3,4-噻二唑基、1,2,5-噻二唑基、四唑基、1,2,3-三嗪基、1,2,4-三嗪基、1,3,5-三嗪基、1,2,3,4-四嗪基、1,2,3,5-四嗪基、1,2,4,5-四嗪基、噻唑基、異噻唑基、噁唑基、異噁唑基、吡唑基、咪唑基。

此處，更佳的是具有 3 個氮原子的五員雜環之雜芳族基團，例如 1,2,3-三唑-1-基、1,2,3-三唑-4-基、1,2,3-三唑-5-基、1,2,5-三唑-1-基、1,2,5-三唑-3-基、1,3,4-三唑-

1-基、1,3,4-三唑-2-基、1,2,4-三唑-3-基、1,2,4-三唑-5-基；

更佳的亦是具有 3 個氮原子的六員雜環之雜芳族基團，例如 1,3,5-三嗪-2-基、1,2,4-三嗪-3-基、1,2,4-三嗪-5-基、1,2,4-三嗪-6-基、1,2,3-三嗪-4-基、1,2,3-三嗪-5-基；

更佳的亦是具有 2 個氮原子和 1 個氧原子的五員雜環之雜芳族基團，例如 1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,3,4-噁二唑-2-基、1,2,3-噁二唑-4-基、1,2,3-噁二唑-5-基、1,2,5-噁二唑-3-基，

更佳的亦是具有 2 個氮原子和一個硫原子的五員雜環之雜芳族基團，例如 1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,3,4-噻二唑-2-基、1,2,3-噻二唑-4-基、1,2,3-噻二唑-5-基、1,2,5-噻二唑-3-基；

更佳的亦是具有 4 個氮原子的五員雜環之雜芳族基團，例如 1,2,3,4-四唑-1-基、1,2,3,4-四唑-5-基、1,2,3,5-四唑-1-基、1,2,3,5-四唑-4-基、2*H*-1,2,3,4-四唑-5-基、1*H*-1,2,3,4-四唑-5-基，

更佳的亦是六員雜環之雜芳族基團，例如 1,2,4,5-四嗪-3-基；

更佳的亦是具有 3 個氮原子和一個氧或硫原子的五員雜環之雜芳族基團，例如 1,2,3,4-噁三唑-5-基；1,2,3,5-噁三唑-4-基；1,2,3,4-噻三唑-5-基；1,2,3,5-噻三唑-4-基；

更佳的亦是六員雜環之雜芳族基團，例如 1,2,4,6-噻三嗪-1-基；1,2,4,6-噻三嗪-3-基；1,2,4,6-噻三嗪-5-基。

另外較佳的是具有選自 N、O 和 S 的雜原子之部份或完全氫化的雜環基之雜環基團或環，例如氧雜環丙烷基、氧雜環丁烷基、噁茂烷基 (= 四氫呋喃基)、噁烷基、吡咯啉基、吡咯烷基或哌啶基。

另外較佳的亦是具有 2 個選自 N、O 和 S 的雜原子之部份或完全氫化的雜環基，例如哌嗪基、二噁茂烷基、噁唑啉基、異噁唑啉基、噁唑烷基、異噁唑烷基和嗎啉基。此外，經取代的雜環基團之適合的取代基是下文所述之取代基，此外亦是酮基。所述之酮基可亦位於可以各種氧化態存在之環雜原子上，例如位於 N 和 S 上。

雜環基的較佳範例是具有 3 至 6 個環原子的雜環基團，選自吡啶基、噻吩基、呋喃基、吡咯基、氧雜環丙烷基、2-氧雜環丁烷基、3-氧雜環丁烷基、噁茂烷基 (= 四氫呋喃基)、吡咯烷基、哌啶基，特別是氧雜環丙烷基、2-氧雜環丁烷基、3-氧雜環丁烷基或噁茂烷基，或具有 2 或 3 個雜原子的雜環基團，例如嘧啶基、噻嗪基、吡嗪基、三嗪基、噻唑基、噻二唑基、噁唑基、異噁唑基、吡唑基、三唑基、哌嗪基、二噁茂烷基、噁唑啉基、異噁唑啉基、噁唑烷基、異噁唑烷基或嗎啉基。

較佳的雜環基團亦包含苯並-縮合或苯並-稠合的雜芳族環，例如苯並呋喃基、苯並異呋喃基、苯並噻吩基、苯並異噻吩基、異苯並噻吩基、吲哚基、異吲哚基、吲唑基、苯並咪唑基、苯並三唑基、苯並噁唑基、1,2-苯並異噁唑基、2,1-苯並異噁唑基、苯並噻唑基、1,2-苯並異噻唑

基、2,1-苯並異噻唑基、1,2,3-苯並噁二唑基、2,1,3-苯並噁二唑基、1,2,3-苯並噻二唑基、2,1,3-苯並噻二唑基、喹啉基、異喹啉基、噌啉基、酞嗪基、喹啉基、喹噁啉基、蔡啶基、苯並三嗪基、嘌呤基、蝶啶基、吡啶基、苯並-1,3-二噁茂基(dioxyl)、4H-苯並-1,3-二氧雜環己二烯基、和 4H-苯並-1,4-二氧雜環己二烯基、及可能的話，其N-氧化物及鹽類。

當基礎結構是經選自一群基團或一般定義的基團之“一或多個基團”取代時，此基礎結構在各種情況分別包含被數個相同和/或結構上不同的基團同時取代。

經取代的基團，例如經取代的烷基、烯基、炔基、環烷基、芳基、苯基、苄基、雜環基和雜芳基，是，例如，由未經取代的基礎結構衍生之經取代的基團，其中該取代基是，例如一或多個，較佳 1、2 或 3 個選自下列的基團：鹵素、烷氧基、烷硫基、羥基、胺基、硝基、羧基、氰基、疊氮基、烷氧羰基、烷羰基、甲醯基、胺甲醯基、單-和二烷基胺羰基、經取代的胺基例如醯基胺基、單-和二烷基胺基、和烷亞磺醯基、烷磺醯基，及在環狀基團的情況，亦是烷基、鹵烷基、烷硫基烷基、烷氧基烷基、任意經取代的單-和二烷基胺基烷基和羥基烷基；“經取代的基團”乙辭中，例如經取代的烷基等，取代基除了所述之飽和羥基以外亦包含對應的未飽和脂族和芳族基團，例如任意經取代的烯基、炔基、烯氧基、炔氧基、苯基、苯氧基等。在環中具有脂族基團之經取代的環狀基團之情況中

，亦包含具有以雙鍵鍵結至環之取代基的環狀系統，例如經亞烷基取代者，例如經亞甲基或亞乙基取代者。

舉例說明的取代基(“第一取代層級”)，當其含有烴基時，可任意地進一步經取代(“第二取代層級”)，例如經第一取代層級中所定義的取代基之一者取代。對應之更高的取代層級是可能的。“經取代的基團”乙辭較佳只包含一或二取代層級。

“基礎基團”意指連結有一個取代層級的取代基之基團的個別基礎結構。

所述之取代層級之較佳的取代基是例如下列：

胺基、羥基、鹵素、硝基、氰基、巯基、羧基、醯胺、 $\text{SF}_5$ 、胺磺醯基、烷基、環烷基、烯基、環烯基、炔基、單烷基胺基、二烷基胺基、N-烷醯基胺基、烷氧基、烯氧基、炔氧基、環烷氧基、環烯氧基、烷氧羰基、烯氧羰基、炔氧羰基、芳氧羰基、烷醯基、烯羰基、炔羰基、芳基羰基、烷硫基、環烷硫基、烯硫基、環烯硫基、炔硫基、烷亞磺醯基、烷磺醯基、單烷基胺磺醯基、二烷基胺磺醯基、N-烷基胺羰基、N,N-二烷基胺羰基、N-烷醯基胺羰基、N-烷醯基-N-烷基胺羰基、芳基、芳氧基、苄基、苄氧基、苄硫基、芳硫基、芳基胺基和苄基胺基。

亦可能二個取代基一起形成飽和或未飽和烴橋或其中碳原子、CH 基團或  $\text{CH}_2$  基團被雜原子所取代之對應的橋，如此形成縮合或稠合的環。較佳的是以基礎結構為基礎的苯並-稠合系統。

任意經取代的苯基較佳是苯基或是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代的苯基：鹵素、氰基、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基和硝基之基團所取代的苯基，特別是任意經一或多個選自鹵素、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基和 $(C_1-C_4)$ -烷氧基。

在基團具有碳原子的情況，較佳的是具有 1 至 6 個碳原子，較佳是 1 至 4 個碳原子，特別是 1 或 2 個碳原子。通常，較佳的取代基是選自下列的基團：鹵素（例如氟和氯）、 $(C_1-C_4)$ -烷基（較佳是甲基或乙基）、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基（較佳是三氟甲基）、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基（較佳是甲氧基或乙氧基）、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基、硝基和氰基。特別佳的取代基是甲基、甲氧基、氟和氯。

經取代的胺基（例如單-或二取代的胺基）是選自經取代的胺基之基團，其是例如經一或二個相同或不同之選自烷基、烷氧基、醯基和芳基之基團所 N-取代；較佳是單-和二烷基胺基、單-和二芳基胺基、醯基胺基、N-烷基-N-芳基胺基、N-烷基-N-醯基胺基和 N-雜環；較佳的是具有 1 至 4 個碳原子的烷基；芳基較佳是苯基或經取代的苯基；醯基是如下所定義，較佳是 $(C_1-C_4)$ -烷醯基。同樣的定義亦應用於經取代的羥基胺基或胍基。

醯基是有機酸的一個基團，形式上是藉由除去酸官能基上的羥基而形成，且該酸中的有機基團亦可經由雜原子

鍵結至該酸官能基。醯基的範例是羧酸  $\text{HO-CO-R}$  中的  $\text{-CO-R}$  基團及由彼所衍生之酸的醯基基團，例如硫代羧酸、任意地  $\text{N-}$ 經取代的亞胺基羧酸之醯基基團，或碳酸單酯、 $\text{N-}$ 經取代的胺基甲酸、磺酸、亞磺酸、 $\text{N-}$ 經取代的磺醯胺酸、膦酸或亞膦酸之醯基基團。

醯基是，例如，甲醯基、烷羰基(例如  $[(\text{C}_1\text{-C}_4)\text{-烷基}]$  羰基)、苯羰基、烷氧羰基、苯氧羰基、苄氧基羰基、烷磺醯基、烷亞磺醯基、 $\text{N-}$ 烷基-1-亞胺基烷基和有機酸的其他基團。所述之基團之烷基或苯基可分別進一步地經取代，例如烷基可經一或多個選自鹵素、烷氧基、苯基和苯氧基的基團所取代；苯基的取代基之範例是上文所述經取代的苯基之通常的取代基。

醯基較佳是狹義的醯基，即為酸基團係直接鍵結至有機基團的碳原子之有機酸的醯基基團，例如甲醯基、烷羰基(例如乙醯基或  $[(\text{C}_1\text{-C}_4)\text{-烷基}]$  羰基)、苯羰基、烷磺醯基、烷亞磺醯基和其他有機酸的醯基基團。

更佳地，醯基是具有 1 至 6 個碳原子，特別是 1 至 4 個碳原子之烷醯基。其中， $(\text{C}_1\text{-C}_4)\text{-}$ 烷醯基是具有 1 至 4 個碳原子的烷酸基團在除去酸基的  $\text{OH}$  基團後之基團，即甲醯基、乙醯基、正丙醯基、異丙醯基或正-、異-、第二-或第三丁醯基。

基團的“基-位置”表示具有自由鍵的碳原子。

本發明之式 (I) 所示化合物和本發明所用之式 (I) 所示化合物(及適當的話，其鹽)亦簡稱為“化合物 (I)”。

本發明亦提供涵蓋在式(I)的範圍內之所有立體異構物和其混合物。所述之式(I)所示化合物含有一或多個不對稱碳原子或者一或多個通式(I)未明確指明的雙鍵。由其特定的三度空間形狀所定義之可能的立體異構物，例如鏡像異構物、非鏡像異構物、Z-和 E-異構物，均涵蓋在式(I)範圍內，且可由立體異構物的混合物藉由慣用的方法而得到，或利用立體選擇反應再加上利用立體化學純質的起始物而製得。

本發明亦提供式(I)所示化合物之可藉由移動氫原子而形成的所有互變異構物(例如酮/烯醇互變異構物)。互變異構物亦包含在式(I)所示化合物的範圍內，即使一般式(I)只描述一種平衡中的互變異構物或只描述一種可正確地相互轉換的互變異構物中之一者。

式(I)所示化合物亦包含所有物理形態，其中這些形態可能以純物質的形態存在或任意地以其他化合物的混合物之形態存在，特別亦是式(I)所示化合物之多晶形結晶形態或其鹽或溶劑化物(例如水合物)。

特別是爲了較高的除草活性、特別是較佳的選擇性和/或較佳的可製造性之理由，特別有興趣的是個別的基團具有上文已提及或下文提及的較佳定義中之一者之上述本發明式(I)所示化合物或其鹽及其於本發明的用途，或者特別是具有一或多個上文已提及或下文提及的較佳定義之組合者。

不管各個情況之選自  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  和  $(R^6)_n$  的

其他基團及對應於一般基團的次定義，較佳是與一或多個這些基團的較佳定義之組合，特別有興趣之本發明化合物或本發明之化合物的用途是具有下列基團的較佳定義者。

較佳的是本發明之式 (I) 所示化合物或其鹽，其中  $R^1$  是氫、烷基、烯基、炔基、環烷基、環烯基、環炔基或芳基，其中該 7 個最後提及的基團是未經取代或經取代，及具有(含取代基)至多 30 個碳原子，較佳是至多 24 個碳原子，特別是至多 20 個碳原子，或具有 3 至 9 個環原子的雜環基團，其含有 1 至 4 個選自 N、O 和 S 的雜原子，其係未經取代或經取代，及其具有(含取代基) 1 至 30 個碳原子，較佳是 1 至 24 個碳原子，特別是 1 至 20 個碳原子。

其中，更佳的亦是化合物 (I) 或其鹽，其中

$R^1$  是氫。

其中，更佳的亦是化合物 (I) 或其鹽，其中

$R^1$  是 H、(C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>18</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>18</sub>)-炔基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-環烷基、(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環烯基、(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環炔基或苯基，其中該 7 個最後提及的基團是未經取代或經取代，及具有(含取代基)至多 30 個碳原子，較佳是至多 24 個碳原子，特別是至多 20 個碳原子。

其中，更佳的亦是化合物 (I) 或其鹽，其中

$R^1$  是 H、(C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>18</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>18</sub>)-炔基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-環烷基、(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環烯基、(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環炔基或苯基，

其中該 7 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自下列的基團所取代：

鹵素、氰基、氫硫基(thio)、硝基、羥基、以及羧基、 $(C_1-C_8)$ -烷基、 $(C_1-C_8)$ -鹵烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_2-C_8)$ -烯基、 $(C_2-C_8)$ -鹵烯基、 $(C_2-C_8)$ -炔基、 $(C_2-C_8)$ -鹵炔基(該 7 個最後提及的基團只有在環狀基礎基團的情況存在)、 $(C_1-C_8)$ -烷氧基、 $(C_2-C_8)$ -烯氧基、 $(C_2-C_8)$ -炔氧基、 $(C_1-C_8)$ -鹵烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基- $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_8)$ -烷硫基、 $(C_2-C_8)$ -烯硫基、 $(C_2-C_8)$ -炔硫基、式  $-NR^*R^{**}$ 、 $-CO-NR^*R^{**}$  和  $-O-CO-NR^*R^{**}$  所示的基團，

其中該 3 個最後提及的化式中之  $R^*$  和  $R^{**}$  基團彼此各自獨立地是 H、 $(C_1-C_8)$ -烷基、 $(C_2-C_8)$ -烯基、 $(C_2-C_8)$ -炔基、苄基、經取代的苄基、苯基或經取代的苯基，或與氮原子一起為 3-至 8-員雜環，而其除了氮原子以外可亦含有一或二個選自 N、O 和 S 之其他的環雜原子，及其是未經取代或經一或多個選自  $(C_1-C_4)$ -烷基和  $(C_1-C_4)$ -鹵烷基之基團所取代，

及  $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]硫羰基、 $[(C_2-C_8)$ -烯氧基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ -炔氧基]羰基、 $[(C_1-C_8)$ -烷硫基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ -烯硫基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ -炔硫基]羰基、 $(C_1-C_8)$ -烷醯基、 $[(C_2-C_8)$ -烯基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ -炔基]羰基、 $(C_1-C_4)$ -烷基亞胺基

、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基亞胺基、 $[(C_1-C_8)$ -烷基]羰胺基、 $[(C_2-C_8)$ -烯基]羰胺基、 $[(C_2-C_8)$ -炔基]羰胺基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]羰胺基、 $[(C_2-C_8)$ -烯氧基]羰胺基、 $[(C_2-C_8)$ -炔氧基]羰胺基、 $[(C_1-C_8)$ -烷基胺基]羰胺基、 $[(C_1-C_6)$ -烷基]羰氧基、 $[(C_2-C_6)$ -烯基]羰氧基、 $[(C_2-C_6)$ -炔基]羰氧基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]羰氧基、 $[(C_2-C_8)$ -烯氧基]羰氧基、 $[(C_2-C_8)$ -炔氧基]羰氧基、 $(C_1-C_8)$ -烷亞磺醯基和 $(C_1-C_8)$ -烷磺醯基，

其中該 27 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自鹵素、 $NO_2$ 、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基和任意經取代的苯基之基團所取代，

及苯基、苯基- $(C_1-C_6)$ -烷氧基、苯基- $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基、苯氧基、苯氧基- $(C_1-C_6)$ -烷氧基、苯氧基- $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基、苯氧羰基、苯羰氧基、以及苯氧羰氧基、苯羰胺基、苯基- $[(C_1-C_6)$ -烷基]羰胺基、苯基- $[(C_1-C_6)$ -烷基]羰氧基、以及苯基- $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰氧基、 $(C_3-C_7)$ -環烷基、 $(C_3-C_7)$ -環烷氧基、以及 $(C_3-C_6)$ -環烷基- $(C_1-C_6)$ -烷氧基、以及 $(C_3-C_6)$ -環烷基- $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基、以及 $(C_3-C_6)$ -環烷氧基- $(C_1-C_6)$ -烷氧基、以及 $(C_3-C_6)$ -環烷氧基- $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基、以及 $(C_3-C_6)$ -環烷氧羰基、以及 $(C_3-C_6)$ -環烷羰氧基、以及 $(C_3-C_6)$ -環烷氧羰氧基、以及 $(C_3-C_6)$ -環烷基- $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰氧基、以及 $(C_3-C_6)$ -環烷羰胺基、以及 $(C_3-C_6)$ -環烷基- $[(C_1-C_6)$ -

烷基]羰胺基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]羰氧基，

其中該 26 個最後提及的基團任意地亦稠合至碳環或雜環，較佳是具有 3 至 6 個碳原子的碳環或具有 5 或 6 個環原子和 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之雜環，較佳是苯並-稠合的，及該環或多環系統是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基和硝基之基團所取代，

及下式所示的基團： $-\text{SiR}'_3$ 、 $-\text{O}-\text{SiR}'_3$ 、 $(\text{R}')_3\text{Si}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-烷氧基}$ 、 $-\text{CO}-\text{O}-\text{NR}'_2$ 、 $-\text{O}-\text{N}=\text{CR}'_2$ 、 $-\text{N}=\text{CR}'_2$ 、 $-\text{O}-\text{NR}'_2$ 、 $-\text{CH}(\text{OR}')_2$  和  $-\text{O}-(\text{CH}_2)_m-\text{CH}(\text{OR}')_2$ ，

其中各個基團 R'彼此各自獨立地是 H、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基或苯基，而該苯基是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基和硝基之基團所取代，或經(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-伸烷基橋取代在 2 個相鄰的位置，和 m 是 0 至 6 之整數，

及式  $\text{R}''\text{O}-\text{CHR}'\text{''}\text{CH}(\text{OR}'')-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-烷氧基}$  所示基團，

其中各個基團 R''彼此各自獨立地為 H 或 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基，或基團 R''一起為(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-伸烷基，及 R'''是 H 或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基，

以及式 Het<sup>1</sup> 所示基團，其中 Het<sup>1</sup> 在各個情況彼此各

自獨立地為飽和、部份未飽和或雜芳族雜環基團，具有 3 至 9 個環原子，較佳是具有 5 或 6 個環原子，其中該雜環基團含有選自 N、O 和 S 之 1 至 4 個雜原子，較佳是 1 至 3 個環雜原子，任意地亦稠合至碳環或雜環，較佳是具有 3 至 6 個碳原子的碳環或具有 5 或 6 個環原子和 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之雜環，較佳是苯並-稠合，及該環或多環系統是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素、氰基、氫硫基、硝基、羥基、羧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔硫基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基]羰基和酮基，

或

R<sup>1</sup> 是以 (C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-環烷基、(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環烯基、(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環炔基或苯基為底的多環基團，其中該基礎環係稠合至碳環或雜環，較佳是具有 0 或 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之 5-或 6-員環，較佳是苯並-稠合，及其

中該基礎環或多環系統是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素、氰基、氫硫基、硝基、羥基、羧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔硫基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基]羰基和酮基，

或

R<sup>1</sup> 是飽和、部份未飽和或雜芳族雜環基團，具有 3 至 9 個環原子，較佳是具有 5 或 6 個環原子，其含有選自 N、O 和 S 之 1 至 4 個雜原子，較佳是 1 至 3 個環雜原子，及任意地亦稠合至碳環或雜環，較佳是具有 0 或 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之 5-或 6-員環，較佳是苯並-稠合，及該環或多環系統是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素、氰基、氫硫基、硝基、羥基、羧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔硫基、

(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基]羰基和酮基。

其中，更佳的亦是化合物(I)或其鹽，其中

R<sup>1</sup> 是 H、(C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>18</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>18</sub>)-炔基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-環烷基、(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環烯基、(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環炔基或苯基，

其中該 7 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自下列的基團所取代：鹵素、氰基、氫硫基、硝基、羥基、以及羧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵炔基(該 7 個最後提及的基團只有在環狀基礎基團的情況存在)、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔硫基、式 -NR<sup>\*</sup>R<sup>\*\*</sup>、-CO-NR<sup>\*</sup>R<sup>\*\*</sup>和 -O-CO-NR<sup>\*</sup>R<sup>\*\*</sup>所示的基團，

其中該 3 個最後提及的化式中之各個基團 R<sup>\*</sup>和 R<sup>\*\*</sup>彼此各自獨立地是 H、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔基、苄基、經取代的苄基、苯基或經取代的苯基，或與氮原子一起為 3-至 8-員雜環，而其除了氮原子以外可另外含有一或二個選自 N、O 和 S 的其他環雜原子，且其是未經取代或經一或多個選自(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基和

(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基之基團所取代，  
 及 [(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基]硫羰基、  
 [(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯氧基]羰基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔氧基]羰基、  
 [(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷硫基]羰基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯硫基]羰基、  
 [(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔硫基]羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷醯基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯  
 基]羰基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔基]羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基亞胺基  
 、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基亞胺基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷基]羰胺基、  
 [(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯基]羰胺基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔基]羰胺基、  
 [(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基]羰胺基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯氧基]羰胺基、  
 [(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔氧基]羰胺基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷基胺基]羰胺基  
 、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]羰氧基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基]羰氧基、  
 [(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基]羰氧基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基]羰氧基、  
 [(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯氧基]羰氧基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔氧基]羰氧基、  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷亞磺醯基和(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷磺醯基，

其中該 27 個最後提及的基團是未經取代或經一  
 或多個選自鹵素、NO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基和任意  
 經取代的苯基之基團所取代，

及苯基、苯基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧  
 基]羰基、苯氧基、苯氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、苯氧基-  
 [(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰基、苯氧羰基、苯羰氧基、以及  
 苯氧羰氧基、以及苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰氧基、苯  
 羰胺基、苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]羰胺基、苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
 烷基]羰氧基、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-環烷基和(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-環烷氧基、  
 以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧羰基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷羰氧基、

以及 (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧羰氧基、以及 (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基 - [(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]羰氧基、以及 (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基 - [(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]羰氧基，

其中該 20 個最後提及的基團之環是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基和硝基之基團所取代，

及下式所示的基團： $-\text{SiR}'_3$ 、 $-\text{O}-\text{SiR}'_3$ 、 $(\text{R}')_3\text{Si}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-烷氧基}$ 、 $-\text{CO}-\text{O}-\text{NR}'_2$ 、 $-\text{O}-\text{N}=\text{CR}'_2$ 、 $-\text{N}=\text{CR}'_2$ 、 $-\text{O}-\text{NR}'_2$ 、 $-\text{CH}(\text{OR}')_2$  和  $-\text{O}-(\text{CH}_2)_m-\text{CH}(\text{OR}')_2$ ，

其中各個基團 R' 彼此各自獨立地是 H、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基或苯基，而該苯基是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基和硝基之基團所取代，或經 (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-伸烷基橋取代在 2 個相鄰的位置，及 m 是 0 至 6 的整數，

及式  $\text{R}''\text{O}-\text{CHR}'\text{''}-\text{CH}(\text{OR}'')-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-烷氧基}$  所示基團，

其中各個基團 R'' 彼此各自獨立地為 H 或 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基，或一起為 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-伸烷基，及 R'''' 是 H 或 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基，

以及式  $\text{Het}^1$  所示基團，其中  $\text{Het}^1$  於各個情況彼此各自獨立地為具有 5 或 6 個環原子之飽和、部份未飽和或雜芳族雜環基團，其中該各個雜環基團分別含有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原

子，及任意地亦稠合至碳環或雜環，較佳是具有 0 或 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之 5-或 6-員環，較佳是苯並-稠合，及該環或多環系統是未經取代或經一或多個選自鹵素、羥基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基之基團所取代。

其中，更佳的亦是化合物(I)或其鹽及用途，其中

R<sup>1</sup> 是 H、(C<sub>1</sub>-C<sub>12</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>12</sub>)-炔基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基、(C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>)-環烯基、(C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>)-環炔基或苯基，

其中該 7 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素、氰基、氫硫基、硝基、羥基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵炔基(該 7 個最後提及的基團只有在環狀基礎基團的情況存在)、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔硫基、式 -NR<sup>\*</sup>R<sup>\*\*</sup>、-CO-NR<sup>\*</sup>R<sup>\*\*</sup>和 -O-CO-NR<sup>\*</sup>R<sup>\*\*</sup>所示的基團，

其中該 3 個最後提及的化式中之各個基團 R<sup>\*</sup>和 R<sup>\*\*</sup>彼此各自獨立地是 H、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-炔基、苄基、苯基(未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、

(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基之基團所取代)  
 ，或與氮原子一起為哌啶、哌嗪、吡咯烷、吡  
 啶烷、哌啶烷或嗎啉基團(未經取代或經一或多  
 個選自(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基之基團所  
 取代)，

及[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]羰胺基、  
 [(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基]羰胺基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基胺基]羰胺基  
 、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]羰氧基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基]羰氧基和  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷磺醯基，

其中該 7 個最後提及的基團是未經取代或經一  
 或多個選自下列之基團所取代：鹵素、NO<sub>2</sub>、  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基和苯基，而該苯基是未經取代或  
 經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-  
 烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基和  
 硝基之基團所取代，

及苯基、苯基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧  
 基]羰基、苯氧基、苯氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、苯氧基-  
 [(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基]羰基、苯氧羰基、苯羰氧基、苯羰  
 胺基、苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]羰胺基、苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷  
 基]羰氧基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基和(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧基，

其中該 13 個最後提及的基團之環是未經取代的  
 或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-  
 C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧  
 基和硝基之基團所取代，

及下式所示的基團： $-\text{CO}-\text{O}-\text{NR}'_2$ 、 $-\text{O}-\text{N}=\text{CR}'_2$ 、 $-\text{N}=\text{CR}'_2$ 、 $-\text{O}-\text{NR}'_2$ 、 $-\text{CH}(\text{OR}')_2$  和  $-\text{O}-(\text{CH}_2)_m-\text{CH}(\text{OR}')_2$ ，

其中各個基團  $\text{R}'$  彼此各自獨立地是  $\text{H}$ 、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷基或苯基，而該苯基是未經取代或經一或多個選自鹵素、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷基、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -鹵烷基、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -鹵烷氧基和硝基之基團所取代，或是經  $(\text{C}_2-\text{C}_6)$ -伸烷基橋取代在 2 個相鄰的位置，及  $m$  是 0 至 6 之整數，

及式  $\text{R}''\text{O}-\text{CHR}'''\text{CH}(\text{OR}'')-(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -烷氧基所示基團，

其中各個基團  $\text{R}''$  彼此各自獨立地為  $\text{H}$  或  $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷基，或基團  $\text{R}''$  一起為  $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -伸烷基，及  $\text{R}'''$  是  $\text{H}$  或  $(\text{C}_1-\text{C}_2)$ -烷基。

其中，更佳的亦是化合物 (I) 或其鹽，其中

$\text{R}^1$  是  $\text{H}$ 、 $(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -烷基、 $(\text{C}_2-\text{C}_6)$ -烯基、 $(\text{C}_2-\text{C}_6)$ -炔基或  $(\text{C}_3-\text{C}_6)$ -環烷基，

其中該 4 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素、 $(\text{C}_1-\text{C}_6)$ -烷基（在環狀基礎基團的情況後者方為取代基）、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷氧基、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷硫基、 $(\text{C}_3-\text{C}_6)$ -環烷基（未經取代或經一或多個選自鹵素和  $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷基之基團所取代）、和苯基（未經取代或經一或多個選自鹵素、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷基、 $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -烷氧基和  $(\text{C}_1-\text{C}_4)$ -鹵烷基之基團所取代）。

其中，特別佳的亦是化合物 (I) 或其鹽，其中

$R^1$  是 H、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_2-C_4)$ -烯基或  $(C_2-C_4)$ -炔基，其中該 3 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基、環丙基、環丁基(其中該 2 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自鹵素和  $(C_1-C_4)$ -烷基之基團所取代)、和苯基(未經取代或經一或多個選自鹵素、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基和  $(C_1-C_4)$ -鹵烷基之基團所取代)。

其中，更佳的是

$R^1$  亦是以  $(C_3-C_9)$ -環烷基、 $(C_5-C_9)$ -環烯基、 $(C_5-C_9)$ -環炔基或苯基為底的多環基團，其中該基礎環係稠合至碳環或雜環，較佳是具有 0 或 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之 5-或 6-員環，較佳是苯並-稠合，及其中該基礎環或多環系統是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素、氰基、硝基、 $(C_1-C_6)$ -烷基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基- $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_2-C_4)$ -烯基、 $(C_2-C_4)$ -炔基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基- $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基、 $(C_3-C_6)$ -環烷基、 $(C_3-C_6)$ -環烷氧基、 $[(C_1-C_4)$ -烷氧基]羰基和  $[(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基]羰基。

較佳的亦是化合物(I)或其鹽，其中

$R^1$  是飽和、部份未飽和或雜芳族雜環基團，具有 3 至 9 個環原子，較佳是 5 或 6 個環原子，其含有選自 N、O 和 S 之 1 至 4 個雜原子，較佳是 1 至 3 個環雜原子

，及其是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素、氰基、氫硫基、硝基、羥基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔硫基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基]羰基和酮基。

較佳的亦是化合物 (I) 或其鹽，其中

$R^1$  是式  $SiR^aR^bR^c$ 、 $-NR^aR^b$  或  $-N=CR^cR^d$  所示的基團，較佳是式  $-NR^aR^b$  或  $-N=CR^cR^d$  所示的基團，

其中該 5 個最後提及的化式中之各個基團  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$  和  $R^d$  彼此各自獨立地是氫、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-炔基、苄基、經取代的苄基、苯基或經取代的苯基，或  $R^a$  和  $R^b$  與氮原子一起為 3-至 8-員雜環，而其除了氮原子以外可亦含有一或二個選自 N、O 和 S 的其他環雜原子，及其是未經取代或經一或多個選自 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基和 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基之基團所取代，或  $R^c$  和  $R^d$  與碳原子一起為 3-至 8-員碳環基團或可含有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之雜環基團，其中該碳環或雜環基團是未經取代或經一或多個選自 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基和 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基之基團所取代。

其中，特別佳的亦是化合物(I)或其鹽，其中

$R^1$  是 H、甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、第二丁基、異丁基、第三丁基、烯丙基、炔丙基(丙-2-炔-1-基)、丁-2-炔-1-基、丁-3-炔-1-基、2-氯丙-2-烯-1-基、3-苯基丙-2-炔-1-基、3,3-二氯丙-2-烯-1-基、3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基、甲基丙-2-炔-1-基、2-甲基丙-2-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、丁-3-烯-1-基、丁-2-炔-1-基、丁-3-炔-1-基、4-氯丁-2-炔-1-基、3-甲基丁-2-烯-1-基、3-甲基丁-1-烯-1-基、1-(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基、(E)-戊-3-烯-2-基或(Z)-戊-3-烯-2-基，苯基、2-羧基苯基、2-氯苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、2-氟苯基、3-氟苯基、4-氟苯基、3-甲氧基苯基、4-甲氧基苯基、2-甲氧基苯基、3-甲氧基苯基、4-甲氧基苯基、苄基、2-苯基乙基、1-苯基乙基、(4-氯苯基)甲基[即 =  $CH_2(4-Cl-Ph)$ ]、(4-氟苯基)甲基[即 =  $CH_2(4-F-Ph)$ ]、(4-甲氧基苯基)甲基[即 =  $CH_2(4-OMe-Ph)$ ]、2-甲氧基乙基、2,2,2-三氟乙基、1,1,1-三氟丙-2-基、2,2-二氟乙基、1,3-二氟丙-2-基、2,3-二甲氧基丙基、2,3-二甲氧基丙-2-基、2,2-二甲氧基乙-2-基、2-(2,2,2-三氟乙氧基)乙基、2-氟乙基、2-氯乙基、2-溴乙基、2-碘乙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、1-羥基丙-2-基、2-羥基丙-2-基、2-羥基丙-1-基、3-羥基丙基、3-羥基丙-2-基，

(2-甲氧基乙氧基)甲基；2-(2-甲氧基乙氧基)乙基；

(2-乙氧基乙氧基)甲基；2-(2-乙氧基乙氧基)乙基，  
 (乙醯氧基)甲基、(丙醯氧基)甲基、(2-甲基丙醯氧基)  
 甲基、(2,2-二甲基丙醯氧基)甲基、1-(乙醯氧基)乙基  
 、2-(乙醯氧基)乙基、2-(丙醯氧基)乙基、1-(丙醯氧  
 基)乙基、1-(2-甲基丙醯氧基)乙-1-基、2-(2-甲基丙  
 醯氧基)乙-1-基、2-(2,2-二甲基丙醯氧基)乙基[即 1-(  
 第三丁基羰氧基)乙基]、2-(2,2-二甲基丙醯氧基)乙基  
 ；  
 1-(2,2-二甲基丙醯氧基)-2-甲基丙-1-基、1-(第三丁基  
 羰氧基)-2-甲基丙-1-基，  
 (甲氧基羰基)甲基、(乙氧基羰基)甲基、(正丙氧基羰  
 基)甲基、(異丙氧基羰基)甲基、(正丁氧基羰基)甲基  
 、(第二丁氧基羰基)甲基、(異丁氧基羰基)甲基、(第  
 三丁氧基羰基)甲基、1-(甲氧基羰基)乙基、2-(甲氧  
 基羰基)乙基、1-(乙氧基羰基)乙基、2-(乙氧基羰基)  
 乙基、1-(正丙氧基羰基)乙基、2-(正丙氧基羰基)乙  
 基、1-(異丙氧基羰基)乙基、2-(異丙氧基羰基)乙基  
 、1-(正丁氧基羰基)乙基、2-(正丁氧基羰基)乙基、1-  
 (第二丁氧基羰基)乙基、2-(第二丁氧基羰基)乙基、  
 1-(異丁氧基羰基)乙基、2-(異丁氧基羰基)乙基、1-(  
 第三丁氧基羰基)乙基、2-(第三丁氧基羰基)乙基，  
 (甲氧基羰氧基)甲基、(乙氧基羰氧基)甲基、(正丙氧  
 基羰氧基)甲基、(異丙氧基羰氧基)甲基、(正丁氧基  
 羰氧基)甲基、(第二丁氧基羰氧基)甲基、(異丁氧基

羰氧基)甲基、(第三丁氧基羰氧基)甲基、1-(甲氧基羰氧基)乙基、2-(甲氧基羰氧基)乙基、1-(乙氧基羰氧基)乙基、2-(乙氧基羰氧基)乙基、1-(正丙氧基羰氧基)乙基、2-(正丙氧基羰氧基)乙基、1-(異丙氧基羰氧基)乙基、2-(異丙氧基羰氧基)乙基、1-(正丁氧基羰氧基)乙基、2-(正丁氧基羰氧基)乙基、1-(第二丁氧基羰氧基)乙基、2-(第二丁氧基羰氧基)乙基、1-(異丁氧基羰氧基)乙基、2-(異丁氧基羰氧基)乙基、1-(第三丁氧基羰氧基)乙基、2-(第三丁氧基羰氧基)乙基、(環己氧基羰氧基)甲基、1-(環己氧基羰氧基)乙-1-基、2-(環己氧基羰氧基)乙-1-基，  
 (乙醯基)甲基、1-(乙醯基)乙基、2-(乙醯基)乙基、1-(乙醯基)丙基、2-(乙醯基)-丙基、3-(乙醯基)丙基、(丙醯基)甲基、1-(丙醯基)乙基、2-(丙醯基)乙基、1-(丙醯基)丙基、2-(丙醯基)丙基、3-(丙醯基)-丙基、1-(丙醯基)-2-甲基丙基，  
 2-(亞乙基胺氧基)乙基、2-(丙-2-亞基胺氧基)乙基、2-(丁-2-亞基胺氧基)乙基、2-(戊-3-亞基胺氧基)乙基，  
 (N,N-二甲基胺基)甲基、2-(N,N-二甲基胺基)乙-1-基、1-(N,N-二甲基胺基)乙-1-基、2-(N,N-二乙基胺基)乙-1-基、1-(N,N-二乙基胺基)乙-1-基、(N,N-二乙基胺基)甲基，  
 (N,N-二甲基胺羰基)甲基、1-(N,N-二甲基胺羰基)乙

基、2-(N,N-二甲基胺羰基)乙基、(N,N-二乙基胺羰基)甲基、1-(N,N-二乙基胺羰基)乙基、2-(N,N-二乙基胺羰基)乙基，

1-(二甲基胺基)丙-2-基[即 2-(二甲基胺基)-1-甲基乙基]、1-(二乙基胺基)丙-2-基，

三甲基甲矽烷基甲基、1-(三甲基甲矽烷基)乙基、2-(三甲基甲矽烷基)乙基、三乙基甲矽烷基甲基、1-(三乙基甲矽烷基)乙基、2-(三乙基甲矽烷基)乙基，

環丙基、環丙基甲基、1-環丙基乙基、2-環丙基乙基、(1-甲基環丙基)甲基、1-(1-甲基環丙基)乙基、2-(1-甲基環丙基)乙基、(2,2-二氯環丙基)甲基、1-(2,2-二氯環丙基)乙基、2-(2,2-二氯環丙基)乙基、(2,2-二甲基環丙基)甲基、1-(2,2-二甲基環丙基)乙基、2-(2,2-二甲基環丙基)乙基、環丁基甲基、環戊基甲基、環己基甲基，或

吡啶-2-基、吡啶-3-基、吡啶-4-基、2-氯吡啶-3-基、3-氯吡啶-2-基，

噻吩-2-基、噻吩-3-基、2-氯噻吩-3-基、3-氯噻吩-2-基、4-氯噻吩-2-基，

(1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基、1-(1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-基)乙基、2-(1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-基)乙基，

(1-乙基-3-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基、1-(1-乙基-3-甲基-1H-吡啶-4-基)乙基、2-(1-乙基-3-甲基-1H-吡啶-4-

基)乙基，

四氫呋喃-2-基、四氫呋喃-3-基、四氫呋喃-2-基甲基、四氫呋喃-3-基甲基、(5-甲基-2-酮基-1,3-二噁茂-4-基)甲基；

氧雜環丁烷-3-基、(氧雜環丁烷-3-基)甲基、(氧雜環丁烷-2-基)甲基、(1,3-二噁茂烷-2-基)甲基、(1,3-二噁茂烷-4-基)甲基、5-甲基-2-酮基-1,3-二噁茂烷-4-基)甲基、(嗎啉-4-基)甲基；1-(嗎啉-4-基)乙基、2-(嗎啉-4-基)乙基、2,3-二氫-1H-茛-2-基、二氫-1H-茛-3-基、二氫-1H-茛-4-基、二氫-1H-茛-5-基，

1H-茛-2-基、1H-茛-3-基、1H-茛-4-基、1H-茛-5-基、1H-茛-6-基或1H-茛-7-基。

其中，非常特別佳的亦是化合物(I)或其鹽，其中

R<sup>1</sup> 是 H、甲基、乙基、正丙基、異丙基、苯基、苄基、(4-氯苯基)甲基[即 = CH<sub>2</sub>(4-Cl-Ph)]、(4-氟苯基)甲基[即 = CH<sub>2</sub>(4-F-Ph)]、(4-甲氧基苯基)甲基[即 = CH<sub>2</sub>(4-OMe-Ph)]、2-甲氧基乙基、四氫呋喃-2-基甲基、2-(二甲基胺基)乙基、氧雜環丁烷-3-基、(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基、2,2,2-三氟乙基、2,2-二氟乙基、2-氟乙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、環丙基甲基、1-環丙基乙基、(1-甲基環丙基)甲基、(2,2-二氯環丙基)甲基、(2,2-二甲基環丙基)甲基、烯丙基、炔丙基(丙-2-炔-1-基)、2-氯丙-2-烯-1-基、3-苯基丙-2-炔-1-基、3,3-二氯丙-2-烯-1-基、3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基、甲基

丙-2-炔-1-基、2-甲基丙-2-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、丁-3-烯-1-基、丁-2-炔-1-基、丁-3-炔-1-基、4-氯丁-2-炔-1-基、3-甲基丁-2-烯-1-基、3-甲基丁-1-烯-1-基、1-(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基、(E)-戊-3-烯-2-基或(Z)-戊-3-烯-2-基、環丁基甲基、環戊基甲基、環己基甲基或(1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基。

較佳的亦是式(I)所示化合物或其鹽，其中

$R^2$  是氫、鹵素、或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基(未經取代或經一或多個選自鹵素(例如氟或氯)之基團所取代)，較佳是氫或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基，特別是氫、甲基或乙基，非常特別的是氫或甲基。

較佳的亦是式(I)所示化合物或其鹽，其中

$R^3$  是氫、鹵素、或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基(未經取代或經一或多個選自鹵素(例如氟或氯)之基團所取代)，較佳是氫或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基，特別是氫或甲基，非常特別的是氫。

較佳的亦是式(I)所示化合物或其鹽，其中

$R^2$  和  $R^3$  與所相連的碳原子一起為(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基或(C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>)-環烯基，較佳是(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基，其中該3個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自鹵素和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基之基團所取代。

其中，較佳地， $R^2$  和  $R^3$  與所相連的碳原子一起為環丙基、環丁基、環戊基或環己基，特別是環丙基，其中該4個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自鹵素和甲基(較佳是氟、氯和甲基)之基團所取代。

較佳的亦是使用式(I)所示化合物或其鹽，其中

$R^4$  是氫、鹵素、氰基、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_2-C_4)$ -烯基或  
 $(C_2-C_4)$ -炔基，其中該 3 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自鹵素和羥基之基團所取代，較佳是未經取代或經一或多個選自鹵素(例如氟和氯)之基團所取代，或

$(C_3-C_6)$ -環烷基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素和 $(C_1-C_4)$ -烷基之基團所取代，或

苯基，其是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素、硝基、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基- $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基、 $[(C_1-C_4)$ -烷氧基]羰基和 $[(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基]羰基，或

$(C_1-C_4)$ -烷醯基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素(例如氟和氯)、氰基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基和 $(C_1-C_2)$ -烷氧基- $(C_1-C_2)$ -烷氧基之基團所取代，較佳是甲醯基，或

$[(C_1-C_4)$ -烷氧基]羰基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素(例如氟和氯)之基團所取代，或

$[(C_3-C_6)$ -環烷氧基]羰基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素和 $(C_1-C_4)$ -烷基之基團所取代。

更佳的亦是式(I)所示化合物或其鹽，其中

$R^4$  是氫、鹵素(例如氟或氯)、氰基、任意經羥基取代的

(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基 [= (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-羥基烷基]、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、環丙基或環丁基，其中該 2 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自鹵素(例如氟和氯)、和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基之基團所取代，或  
 苯基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基之基團所取代，或  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷醯基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素(例如氟和氯)之基團所取代，較佳是甲醯基，  
 或

[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基]羰基或[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基]羰基，  
 較佳地

R<sup>4</sup> 是氫、鹵素(例如氟或氯)、氰基、甲基、乙基、正丙基、異丙基、CH<sub>2</sub>Cl、CHCl<sub>2</sub>、CCl<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub> 或甲醯基。

其中，更佳的是上述之較佳的或特別佳的化合物(I)或其鹽中之 R<sup>4</sup> 是氰基，或 R<sup>4</sup> 具有除了氰基或甲醯基以外之上述的其他定義中之一者。

更佳的是，R<sup>4</sup> 是上述 R<sup>4</sup> 定義的基團中之一者，且不是氫。

更佳的是，R<sup>4</sup> 是氫。

較佳的亦是式(I)所示化合物或其鹽，其中

R<sup>5</sup> 是未經取代或經取代的苯基，及具有(含取代基) 6 至 24 個碳原子，特別是 6 至 20 個碳原子，或

具有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之 5-或 6-員雜芳族基團，其是未經取代或經取代，及其具有(含取代基) 1 至 24 個碳原子，特別是 1 至 20 個碳原子。

另外更佳的是，

R<sup>5</sup> 是苯基或具有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之 5-或 6-員雜芳族基團，其中該苯基或雜環基是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：

- (a) 鹵素、羥基、胺基、硝基、羧基、氰基和胺甲醯基，
- (b) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基，其中該 6 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺基、羥基、羧基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基]羰基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺羰基和氰基之基團所取代，
- (c) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷硫基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基]羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷醯基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺羰基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-醯基]胺基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺基、N-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-醯基]N-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]胺基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷亞磺醯基、

(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷亞磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷磺醯基、  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷亞磺醯氧基、  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷亞磺醯氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷磺醯氧基、  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷磺醯氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基硫酸基、  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷基硫酸基，和

(d) (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧基、苯基和苯氧基，

其中該 4 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基之基團所取代，

及其中 2 個相鄰的取代基可形成稠合的 5-或 6-員環，而該環是碳環或可另外含有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子，及該環是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基之基團所取代。

另外更佳的是，

R<sup>5</sup> 是苯基，

其是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：

(a) 鹵素、羥基、胺基、硝基、羧基、氰基和胺甲醯基，

(b) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基和(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基，其中該 4 個最後提及的基團是

未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基、羥基、羧基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基]羰基和氰基之基團所取代，

- (c) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷硫基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基]羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷醯基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺羰基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-醯基]胺基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺基、N-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-醯基]-N-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]胺基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷亞磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷亞磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷亞磺醯氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷磺醯氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷磺醯氧基，和
- (d) (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧基、苯基和苯氧基，

其中該 4 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基之基團所取代，

及其中 2 個相鄰的取代基可形成稠合的 5-或 6-員環，而該環是碳環或可另外含有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子，及該環是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基之基團所取代

或

$R^5$  是具有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之 5-或 6-員雜芳族基團，其是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：

- (a) 鹵素、羥基、胺基、硝基、羧基、氰基和胺甲醯基，
- (b)  $(C_1-C_6)$ -烷基、 $(C_2-C_6)$ -烯基、 $(C_2-C_6)$ -炔基和  $(C_1-C_6)$ -烷氧基，其中該 6 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自鹵素、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基、單-和二- $[(C_1-C_4)$ -烷基]胺基、羥基、羧基、 $[(C_1-C_4)$ -烷氧基]羰基和氰基之基團所取代，
- (c)  $(C_1-C_6)$ -烷硫基、 $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_6)$ -鹵烷氧基]羰基、 $(C_1-C_6)$ -烷醯基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷醯基、單-和二- $[(C_1-C_4)$ -烷基]胺羰基、單-和二- $[(C_1-C_6)$ -醯基]胺基、單-和二- $[(C_1-C_4)$ -烷基]胺基、N- $[(C_1-C_6)$ -醯基]-N- $[(C_1-C_6)$ -烷基]胺基、 $(C_1-C_6)$ -烷亞磺醯基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷亞磺醯基、 $(C_1-C_6)$ -烷磺醯基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷磺醯基、 $(C_1-C_6)$ -烷亞磺醯氧基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷亞磺醯氧基、 $(C_1-C_6)$ -烷磺醯氧基和  $(C_1-C_6)$ -鹵烷磺醯氧基，和
- (d)  $(C_3-C_6)$ -環烷基、 $(C_3-C_6)$ -環烷氧基、苯基和苯氧基，

其中該 4 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基之基團所取代，

及其中 2 個相鄰的取代基可形成稠合的 5-或 6-員環，而該環是碳環或可另外含有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子，及該環是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基之基團所取代。

更佳的是使用式(I)所示化合物或其鹽，其中

R<sup>5</sup> 是苯基

其是未經取代的，或較佳是經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素、羥基、胺基、硝基、羧基、氰基、胺甲醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基、以及(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-烯基、以及(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、羥基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、羧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、氰基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基(其亦可任意地被鹵化[=(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基])、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷硫基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基]羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷醯基、單-和

二 -[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺羰基、單 -和二 -[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-醯基]胺基、單 -和二 -[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺基、N-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-醯基]-N-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]胺基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷亞磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷亞磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷磺醯基、以及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷磺醯氧基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)環烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)環烷氧基、苯基和苯氧基，

其中該 4 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基之基團所取代，

及其中 2 個相鄰的取代基可形成稠合的 5-或 6-員環，而該環是碳環或可另外含有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子，及該環是未經取代或經一或多個選自鹵素和(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基之基團所取代，

或

R<sup>5</sup> 是具有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之 5-或 6-員雜芳族基團，

其是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素、羥基、胺基、硝基、羧基、氰基、胺甲醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基、以及(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-烯基、以及(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、單 -和二 -[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、羥

基  $-(C_1-C_4)$ -烷基、羧基  $-(C_1-C_4)$ -烷基、氰基  $-(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_1-C_6)$ -烷氧基(其亦可任意地被鹵化 [=  $(C_1-C_6)$ -鹵烷氧基])、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基  $-(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_6)$ -烷硫基、 $[(C_1-C_6)$ -烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_6)$ -鹵烷氧基]羰基、 $(C_1-C_6)$ -烷醯基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷醯基、單-和二- $[(C_1-C_4)$ -烷基]胺羰基、單-和二- $[(C_1-C_6)$ -醯基]胺基、單-和二- $[(C_1-C_4)$ -烷基]胺基、N- $[(C_1-C_6)$ -醯基]-N- $[(C_1-C_6)$ -烷基]胺基、 $(C_1-C_6)$ -烷亞磺醯基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷亞磺醯基、 $(C_1-C_6)$ -烷磺醯基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷磺醯基、以及 $(C_1-C_4)$ -烷磺醯氧基、 $(C_3-C_6)$ 環烷基、 $(C_3-C_6)$ 環烷氧基、苯基和苯氧基，

其中該 4 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個選自鹵素、 $(C_1-C_4)$ -烷基和 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基之基團所取代，

及其中 2 個相鄰的取代基可形成稠合的 5-或 6-員環，而該環是碳環或可另外含有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子，及該環是未經取代或經一或多個選自鹵素和 $(C_1-C_6)$ -烷基之基團所取代。

其中，更佳的亦是式(I)所示化合物或其鹽，其中  $R^5$  是苯基，而其是未經取代的，或較佳是經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素、羥基、硝基、羧基

、 氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、羥基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧  
 基(其亦可任意地被鹵化[=(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基]、  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基  
 、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基]羰  
 基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷亞磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷亞磺醯基  
 、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷磺醯基、  
 (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)環烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)環烷氧基、苯基和苯氧  
 基，

其中該 4 個最後提及的基團是未經取代或經  
 一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-  
 鹵烷基之基團所取代，

及其中 2 個相鄰的取代基可形成稠合的 5-或 6-  
 員環，而該環是碳環或可另外含有 1 至 3 個選自  
 N、O 和 S 的環雜原子，及該環是未經取代或經  
 一或多個選自鹵素和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基之基團所取代  
 ，

或

R<sup>5</sup> 是具有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之 5-或 6-  
 員雜芳族基團，

其是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取  
 代：鹵素、羥基、羧基、氰基、以及胺基、  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、以及(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-烯基、以及(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-

炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-  
 烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、羥基-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基(其亦可任意地被  
 鹵化 [= (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基]、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧  
 基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基]羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷  
 亞磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷亞磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷磺  
 醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷磺醯基、以及(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷磺醯  
 氧基、以及單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺基、以及苯  
 基和(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基(未經取代或經一或多個選自  
 鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基之基團所取  
 代)，

及其中 2 個相鄰的取代基可形成稠合的 5-或 6-  
 員環，而該環是碳環或可另外含有 1 至 3 個選自  
 N、O 和 S 的環雜原子，及該環是未經取代或經  
 一或多個選自鹵素和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基之基團所取代  
 。

其中，甚至更佳的亦是式(I)所示化合物或其鹽，其中  
 R<sup>5</sup> 是苯基，而其是未經取代的，或較佳是經一或多個選  
 自下列之基團所取代：鹵素、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷  
 基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-  
 烷硫基，且是任意地苯並-稠合，

或

R<sup>5</sup> 是具有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之 5-或 6-

員雜芳族基團，

其是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素、羥基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基、以及(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-炔基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基、苯基、胺基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷磺醯氧基，且是任意地苯並-縮合或苯並-稠合。

特別佳的是式(I)所示化合物或其鹽，其中

R<sup>5</sup> 是苯基，而其是未經取代的，或較佳是經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素(例如氟、氯、溴和碘)、氰基、甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、第二丁基、異丁基、第三丁基、三氟甲基、三氯甲基、甲氧基和乙氧基，且是任意地苯並-稠合，

較佳地

R<sup>5</sup> 是苯基、2-氟苯基、2-氯苯基、2-溴苯基、2-碘苯基、2-甲基苯基、4-(第三丁基)苯基、2-三氟甲基苯基、2-甲氧基苯基、或2-氰基苯基、或2-硝基苯基、或4-硝基苯基、3-氟苯基、3-氯苯基、3-溴苯基、3-碘苯基、3-甲基苯基、3-三氟甲基苯基、3-甲氧基苯基、4-羧基苯基、4-氟苯基、4-氯苯基、4-溴苯基、4-碘苯基、4-甲基苯基、4-三氟甲基苯基、4-甲氧基苯基、2,3-二氯苯基、2,3-二甲基苯基、2,4-二氯苯基、

2,4-二甲基苯基、2,5-二氯苯基、2,5-二甲基苯基、2,6-二氯苯基、或 2,4-二氟苯基、2,6-二甲基苯基、3,4-二氯苯基、或 3,4-二氟苯基、3,4-二甲基苯基、3,5-二氯苯基、3,5-二甲基苯基、2-氯-3-甲基苯基、2-氯-4-甲基苯基、2-氯-5-甲基苯基、2-氯-6-甲基苯基、3-氯-4-甲基苯基、3-氯-5-甲基苯基、3-氯-2-甲基苯基、4-氯-2-甲基苯基、4-氯-3-甲基苯基或 5-氯-2-甲基苯基、4-苯基苯基、3-三氟甲基-4-氯苯基、4-苯氧基-苯基、4-羧基甲基苯基、4-乙醯基苯基 (= 4-甲基羧基苯基) 或 1,3-苯並二噁茂-5-基。

其中，較佳的亦是式(I)所示化合物或其鹽，其中

R<sup>5</sup> 是 2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、2-噁吩基、3-噁吩基、2-呋喃基、3-呋喃基、2-吡咯基、3-吡咯基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、3-噻嗪基、4-噻嗪基、2-吡嗪基、3-吡嗪基、2-咪唑啉基、4-咪唑啉基、1-吡唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、1,3,5-三嗪-2-基、1,2,4-三嗪-3-基、1,2,4-三嗪-5-基、2-噁唑基、1,3-苯並噁唑-2-基、4-噁唑基、5-噁唑基、3-異噁唑基、4-異噁唑基、5-異噁唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、3-異噁唑基、4-異噁唑基、5-異噁唑基、噁二唑基或三唑基、或 3-異喹啉基、2-喹啉基、1,3-苯並噁唑-2-基或 1,3-苯並噁唑-2-基，較佳是 2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、2-嘧啶基、2-吡嗪基、2-噁吩基、3-噁吩基、2-呋喃基或 2-噁唑基、或

是 3-異喹啉基或 2-喹啉基，其中以上提及的雜芳族基團分別是未經取代或經取代的，較佳是經上文已提及的較佳基團取代，特別是經一或多個選自鹵素、羥基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基以及(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基胺基、二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷磺醯氧基之基團取代。

其中，特別佳的亦是式(I)所示化合物或其鹽，其中

R<sup>5</sup> 是 2-吡啶基、3-氟吡啶-2-基、3-氯吡啶-2-基、3-溴吡啶-2-基、3-甲基吡啶-2-基、3-甲氧基吡啶-2-基、3-三氟甲基吡啶-2-基、4-氟吡啶-2-基、4-氯吡啶-2-基、4-溴吡啶-2-基、4-甲基吡啶-2-基、4-甲氧基吡啶-2-基、4-三氟甲基吡啶-2-基、5-氟吡啶-2-基、5-氯吡啶-2-基、5-溴吡啶-2-基、5-甲基吡啶-2-基、5-甲氧基吡啶-2-基、5-三氟甲基吡啶-2-基、6-氟吡啶-2-基、6-氯吡啶-2-基、6-溴吡啶-2-基、6-甲基吡啶-2-基、6-甲氧基吡啶-2-基、6-三氟甲基吡啶-2-基、4,6-二甲基吡啶-2-基，

3-吡啶基、2-氟吡啶-3-基、2-氯吡啶-3-基、2-溴吡啶-3-基、2-甲基吡啶-3-基、2-甲氧基吡啶-3-基、2-三氟甲基吡啶-3-基、4-氟吡啶-3-基、4-氯吡啶-3-基、4-溴吡啶-3-基、4-甲基吡啶-3-基、4-甲氧基吡啶-3-基、4-三氟甲基吡啶-3-基、5-氟吡啶-3-基、5-氯吡啶-3-基、5-溴吡啶-3-基、5-甲基吡啶-3-基、5-甲氧

基吡啶-3-基、5-三氟甲基吡啶-3-基、6-氟吡啶-3-基、6-氯吡啶-3-基、6-溴吡啶-3-基、6-甲基吡啶-3-基、6-甲氧基吡啶-3-基、6-三氟甲基吡啶-3-基、6-羥基吡啶-3-基，

4-吡啶基、2-氟吡啶-4-基、2-氯吡啶-4-基、2-溴吡啶-4-基、2-甲基吡啶-4-基、2-甲氧基吡啶-4-基、2-三氟甲基吡啶-4-基、3-氟吡啶-4-基、3-氯吡啶-4-基、3-溴吡啶-4-基、3-甲基吡啶-4-基、3-甲氧基吡啶-4-基、3-三氟甲基吡啶-4-基、或5-碘吡啶-2-基、5-二甲基胺基吡啶-2-基、5-甲基胺基吡啶-2-基、5-甲硫基吡啶-2-基、5-甲氧基吡啶-2-基、5-二氟甲氧基吡啶-2-基、5-羥基吡啶-2-基、5-乙炔基吡啶-2-基、5-環丙基吡啶-2-基、5-烯丙基吡啶-2-基、5-苯基吡啶-2-基、5-胺基吡啶-2-基或5-甲基磺醯氧基吡啶-2-基，

2-噻吩基、3-氟噻吩-2-基、3-氯噻吩-2-基、3-溴噻吩-2-基、3-甲基噻吩-2-基、3-甲氧基噻吩-2-基、3-三氟甲基噻吩-2-基、4-氟噻吩-2-基、4-氯噻吩-2-基、4-溴噻吩-2-基、4-甲基噻吩-2-基、4-甲氧基噻吩-2-基、4-三氟甲基噻吩-2-基、5-氟噻吩-2-基、5-氯噻吩-2-基、5-溴噻吩-2-基、5-碘-2-噻吩基、5-甲基噻吩-2-基、5-甲氧基噻吩-2-基、5-三氟甲基噻吩-2-基、或5-烯丙基吡啶-2-基、5-乙炔基吡啶-2-基、5-(甲基磺醯氧基)吡啶-2-基或5-甲硫基吡啶-2-基，

3-噻吩基、2-氟噻吩-3-基、2-氯噻吩-3-基、2-溴噻吩-3-基、2-甲基噻吩-3-基、2-甲氧基噻吩-3-基、2-三氟甲基噻吩-3-基、4-氟噻吩-3-基、4-氯噻吩-3-基、4-溴噻吩-3-基、4-甲基噻吩-3-基、4-甲氧基噻吩-3-基、4-三氟甲基噻吩-3-基、5-氟噻吩-3-基、5-氯噻吩-3-基、5-溴噻吩-3-基、5-甲基噻吩-3-基、5-甲氧基噻吩-3-基、5-三氟甲基噻吩-3-基，或

2-呋喃基、3-氟呋喃-2-基、3-氯呋喃-2-基、3-溴呋喃-2-基、3-甲基呋喃-2-基、3-甲氧基呋喃-2-基、3-三氟甲基呋喃-2-基、4-氟呋喃-2-基、4-氯呋喃-2-基、4-溴呋喃-2-基、4-甲基呋喃-2-基、4-甲氧基呋喃-2-基、4-三氟甲基呋喃-2-基、5-氟呋喃-2-基、5-氯呋喃-2-基、5-溴呋喃-2-基、5-甲基呋喃-2-基、5-甲氧基呋喃-2-基或5-三氟甲基呋喃-2-基，

2-噻唑基、4-Me-噻唑-2-基、5-甲基噻唑-2-基、5-溴噻唑-2-基、5-氯噻唑-2-基、4,5-二甲基噻唑-2-基、4,5-二氯噻唑-2-基，

1,3-苯並噻唑-2-基、7-氯-1,3-苯並噻唑-2-基、或2-溴噻唑-4-基、2-氯噻唑-4-基、4-噻唑基、6-氯-1,3-苯並噻唑-2-基、7-溴-1,3-苯並噻唑-2-基、6-溴-1,3-苯並噻唑-2-基、1,3-苯並噻唑-2-基、7-氯-1,3-苯並噻唑-2-基、6-氯-1,3-苯並噻唑-2-基、7-溴-1,3-苯並噻唑-2-基、6-溴-1,3-苯並噻唑-2-基，

2-吡嗪基、5-甲基吡嗪-2-基，

1,5-二甲基吡啶-3-基、或 1-甲基吡啶-3-基、或 1-甲基吡啶-5-基，

2-嘧啶基、5-氟嘧啶-2-基、5-氯嘧啶-2-基、5-溴嘧啶-2-基、或 5-碘嘧啶-2-基或 5-甲基嘧啶-2-基、4,6-二甲基嘧啶-2-基，

3-噻嗪基、6-甲基噻嗪-3-基，

1,2,4-三嗪-3-基或 6-甲基-1,2,4-三嗪-3-基、或 3-異喹啉基或 2-喹啉基，

較佳地

R<sup>5</sup> 是 2-吡啶基、5-氟吡啶-2-基、5-氯吡啶-2-基、5-溴吡啶-2-基、5-甲基吡啶-2-基、5-甲氧基吡啶-2-基、5-三氟甲基吡啶-2-基、3-吡啶基、6-氟吡啶-3-基、6-氯吡啶-3-基、6-溴吡啶-3-基、6-甲基吡啶-3-基、6-甲氧基吡啶-3-基或 6-三氟甲基吡啶-3-基、4,6-Me<sub>2</sub>-吡啶-2-基、2-噁吩基、3-氯噁吩-2-基、3-甲基噁吩-2-基、4-氯噁吩-2-基、4-甲基噁吩-2-基、5-氯噁吩-2-基、5-溴噁吩-2-基、5-碘-2-噁吩基、5-甲基噁吩-2-基、2-噁唑基、5-溴噁唑-2-基、5-氯噁唑-2-基、4,5-二甲基噁唑-2-基、4,5-二氯噁唑-2-基、1,3-苯並噁唑-2-基、2-吡嗪基、5-甲基吡嗪-2-基、1,5-二甲基吡啶-3-基、2-嘧啶基、5-溴嘧啶-2-基、5-甲基嘧啶-2-基、4,6-二甲基嘧啶-2-基、3-噻嗪基或 6-甲基噻嗪-3-基、4-氟吡啶-2-基、4-氯吡啶-2-基、4-溴吡啶-2-基、4-甲基吡啶-2-基

或 4-三氟吡啶-2-基、或 3-異喹啉基或 2-喹啉基。

較佳的亦是式 (I) 所示化合物或其鹽，其中

$(R^6)_n$  是  $n$  個取代基  $R^6$ ，其中當  $n = 1$  時之  $R^6$  或當  $n$  是大於 1 時之各個取代基  $R^6$  彼此各自獨立地為下列基團：鹵素、氰基、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基、 $(C_1-C_4)$ -烷亞磺醯基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷亞磺醯基、 $(C_1-C_4)$ -烷磺醯基或  $(C_1-C_4)$ -鹵烷磺醯基，及

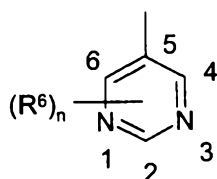
$n$  是 0、1、2 或 3，較佳是 0、1 或 2。

其中，較佳的亦是式 (I) 所示化合物或其鹽，其中

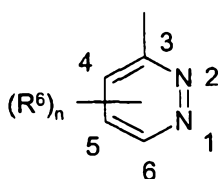
$(R^6)_n$  是  $n$  個取代基  $R^6$ ，其中當  $n = 1$  時之  $R^6$  或當  $n$  是大於 1 時之各個取代基  $R^6$  彼此各自獨立地為下列基團：鹵素(例如氟、氯、溴或碘)、甲基、乙基、三氟甲基、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、甲基磺醯基或乙基磺醯基，及

$n$  是 0、1、2 或 3，較佳是 0、1 或 2。

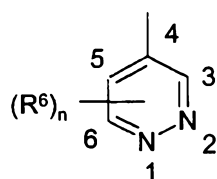
較佳的是式 (I) 所示化合物或其鹽，其中 Het 是式 (Het-a)、(Het-b)、(Het-c) 或 (Het-d) 所示的基團



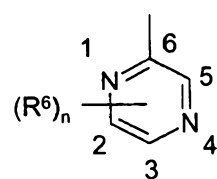
(Het-a)



(Het-b)



(Het-c)



(Het-d)

其中  $(R^6)_n$  具有上述之定義或上述之較佳定義。

更佳的是式 (I) 所示化合物或其鹽，其中

Het 是上述的 (Het-a) 基團，其中

$n$  是 0 (= 數字零，即取代基  $R^6$  不存在，即環上的所有自由鍵均為氫所佔據)，或

$(R^6)_n$  是 2-氟、2-氯、2-氰基、2-甲基、2-乙基、2- $CF_3$ 、2-甲氧基、2-乙氧基、2-甲硫基、2-甲基亞磺醯基、2-甲基磺醯基、4-氟、4-氯、4-溴、4-氰基、4-甲基、4-乙基、4- $CF_3$ 、4-甲氧基、4-乙氧基、4-甲硫基、4-甲基亞磺醯基、4-甲基磺醯基、2,4-二甲基、2,4-二氟、2,4-二氯、4,6-二甲基、4,6-二氟或 4,6-二氯，

其中基團的編號意指該基團在嘧啶-5-基上的位置，其中氮環原子係位於環的 1-和 3-位置。

其中，特別佳的是式 (I) 所示化合物或其鹽，其中

Het 是上述的 (Het-a) 基團，其中  $n = 0$ ，或

$(R^6)_n$  是 4-氟、4-氯、4-甲基、4-三氟甲基、4-甲氧基、4-甲基磺醯基、4-甲基亞磺醯基或 4-甲硫基，較佳是 4-甲基。

更佳的是式 (I) 所示化合物或其鹽，其中

Het 是上述的 (Het-b) 基團

其中

$n$  是 0 (= 數字零，即取代基  $R^6$  不存在，即環上的所有自由鍵均為氫所佔據)，或

$(R^6)_n$  是 4-氟、4-氯、4-溴、4-氰基、4-甲基、4-乙基

、4-三氟甲基、4-甲氧基、4-乙氧基、4-甲硫基、4-甲基亞磺醯基、4-甲基磺醯基、6-氟、6-氯、6-氰基、6-甲基、6-乙基、6-三氟甲基、6-甲氧基、6-乙氧基、6-甲硫基、6-甲基亞磺醯基、6-甲基磺醯基、4,6-二甲基、4,6-二氟或4,6-二氯，

其中基團的編號意指該基團在噻嗪-3-基上的位置，其中氮環原子係位於環的1-和2-位置。

其中，特別佳的是式(I)所示化合物或其鹽，其中 Het 是上述的(Het-b)基團，其中  $n = 0$  或

$(R^6)_n$  是4-氟、4-氯、4-甲基、4-三氟甲基、4-甲氧基、4-甲基磺醯基、4-甲基亞磺醯基或4-甲硫基，較佳是4-甲基。

更佳的是式(I)所示化合物或其鹽，其中 Het 是上述的(Het-c)基團，其中

$n$  是0 (=數字零，即取代基  $R^6$  不存在，即環上的所有自由鍵均為氫所佔據)，或

$(R^6)_n$  是5-氟、5-氯、5-溴、5-氰基、5-甲基、5-乙基、5-三氟甲基、5-甲氧基、5-乙氧基、5-甲硫基、5-甲基亞磺醯基、5-甲基磺醯基、3,5-二甲基、3,5-二氟或3,5-二氯，

其中基團的編號意指該基團在4-噻嗪基上的位置，其中氮環原子係位於環的1-和2-位置。

其中，特別佳的是式(I)所示化合物或其鹽，其中 Het 是上述的(Het-c)基團，其中  $n = 0$ ，或，其中

$(R^6)_n$  是 5-氟、5-氯、5-甲基、5-三氟甲基、5-甲氧基、5-甲基磺醯基、5-甲基亞磺醯基或 5-甲硫基，較佳是 5-甲基。

更佳的是式 (I) 所示化合物或其鹽，其中

Het 是上述的 (Het-d) 基團，其中

$n$  是 0 (=數字零，即取代基  $R^6$  不存在，即環上的所有自由鍵均為氫所佔據)，或

$(R^6)_n$  是 3-氯、3-氟、3-氰基、3-甲基、3-乙基、3- $CF_3$ 、3-甲氧基、3-乙氧基、3-甲硫基、3-甲基亞磺醯基、3-甲基磺醯基、5-氟、5-氯、5-溴、5-氰基、5-甲基、5-乙基、5- $CF_3$ 、5-甲氧基、5-乙氧基、5-甲硫基、5-甲基亞磺醯基、5-甲基磺醯基、3,5-二甲基、3,5-二氟、3,5-二氯，

其中基團的編號意指該基團在 6-吡嗪基上的位置，其中氮環原子係位於環的 1-和 4-位置。

特別佳的是式 (I) 所示化合物或其鹽，其中

Het 是上述的 (Het-d) 基團，其中  $n = 0$ ，或其中

$(R^6)_n$  是 5-氟、5-氯、5-甲基、5-三氟甲基、5-甲氧基、5-甲基磺醯基、5-甲基亞磺醯基或 5-甲硫基，較佳是 5-甲基。

較佳的亦是式 (I) 所示化合物或其鹽，其中

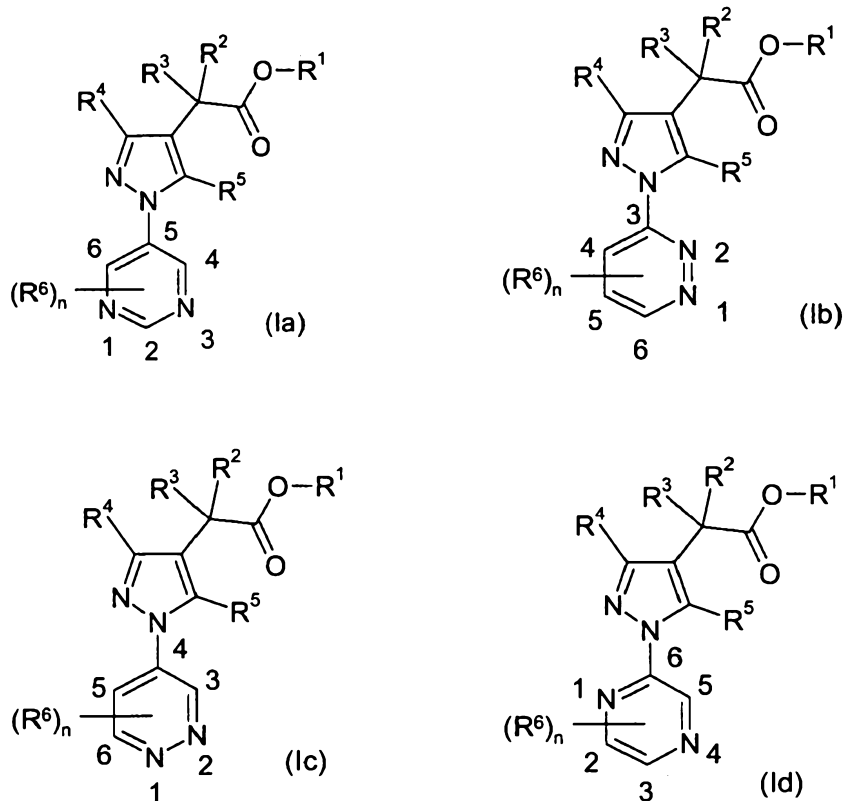
Het 是上述的 (Het-a)、(Het-b)、(Het-c) 或 (Het-d) 基團，

其中各個情況中  $n = 0$ 。

較佳的亦是式 (I) 所示化合物或其鹽，其中基團 Het、

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $n$  係選自 2 或多個上述之較佳的定義。

較佳的式 (I) 所示化合物或其鹽是式 (Ia)、(Ib)、(Ic) 和 (Id) 所示的化合物和其鹽，



其中  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $n$  係如式 (I) 所定義或根據上述之較佳定義。

特別佳的是通式 (Ia) 所示化合物或其鹽，其中

$R^1$  是氫，及  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $n$  係如式 (I) 中所定義 [= 式 (Ia'') 化合物]，或

$R^1$  是甲基，及  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $n$  係如式 (I) 中所定義 [= 式 (Ia''') 化合物]，或

$R^2$  和  $R^3$  分別是氫，及  $R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $n$  係如式 (I) 中所

定義 [= 式 (Ia''''') 化合物]。

特別佳的亦是通式 (Ib) 所示化合物或其鹽，其中

$R^1$  是氫，及  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $n$  係如式 (I) 中所定義 [= 式 (Ib'') 化合物]，或

$R^1$  是甲基，及  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $n$  係如式 (I) 中所定義 [= 式 (Ib''') 化合物]，或

$R^2$  和  $R^3$  分別是氫，及  $R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $n$  係如式 (I) 中所定義 [= 式 (Ib''''') 化合物]。

特別佳的是通式 (Ic) 所示化合物或其鹽，其中

$R^1$  是氫，及  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $n$  係如式 (I) 中所定義 [= 式 (Ic'') 化合物]，或

$R^1$  是甲基，及  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $n$  係如式 (I) 中所定義 [= 式 (Ic''') 化合物]，或

$R^2$  和  $R^3$  分別是氫，及  $R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $n$  係如式 (I) 中所定義 [= 式 (Ic''''') 化合物]。

特別佳的是通式 (Id) 所示化合物或其鹽，其中

$R^1$  是氫，及  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $n$  係如式 (I) 中所定義 [= 式 (Id'') 化合物]，或

$R^1$  是甲基，及  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $n$  係如式 (I) 中所定義 [= 式 (Id''') 化合物]，或

$R^2$  和  $R^3$  分別是氫，及  $R^1$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  和  $n$  係如式 (I) 中所定義 [= 式 (Id''''') 化合物]。

其中，特別佳的是式 (I)、(Ia)、(Ib)、(Ic) 和 (Id) 所示之化合物及其鹽類，其中基團  $R^1$  至  $R^6$  之一或多者具有實

例表中所用的基團定義。

其中，特別佳的是式(I)所示化合物及其鹽類，其中基團  $R^1$  至  $R^6$  之一或多者具有實例表中所用的基團定義。

本發明之式(I)所示化合物包含基於分子內的不對稱中心或雙鍵而發生之所有立體異構物(而其構型未於化式中明確指定或未詳細指明)和其混合物，包含外消旋化合物和部份富含特定立體異構物之混合物。

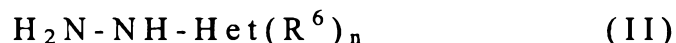
若存在有官能基，適當的話，本發明亦包含所有互變異構物(例如酮基和烯醇互變異構物)，及其混合物和鹽。

本發明亦提供製造通式(I)所示化合物和/或其鹽之方法。

本發明之式(I)所示化合物可利用各種不同的方法製造。

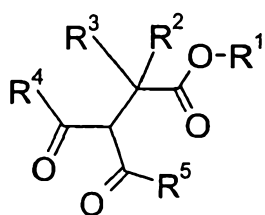
以下所述之方法中，在某些情況，可使用溶劑。此時，“惰性溶劑”於各種情況中意指在特定反應條件下為惰性但不必是對所有反應條件均為惰性之溶劑。

(a) 為了製造  $Het$ 、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  具有上述式(I)的定義之通式(I)化合物或其鹽，式(II)所示化合物



其中  $Het$  和  $(R^6)_n$  係如式(I)中所定義，

與式(III)所示化合物反應，



(III)

其中 R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 係如式 (I) 中所定義，

得式 (I) 所示化合物或其鹽。

方法 (a) 對下列之式 (I) 和 (II) 所示化合物是較佳的：其中 Het 是上述式 (Het-a) 的基團 (= 嘧啶-5-基) 且 n 不是 0，或其中 Het 是上述式 (Het-b) 的基團 (= 噻嗪-3-基) 且 n 不是 0，或其中 Het 是上述式 (Het-c) 的基團 (= 噻嗪-4-基)，或其中 Het 是上述式 (Het-d) 的基團 (= 吡嗪-6-基)。

在製造式 (I) 所示化合物之本發明的方法 (a) 中用作為起始物之式 (III) 所示之經取代的 1,3-二羰基化合物較佳是基團 R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> 和 R<sup>5</sup> 具有上文有關本發明之較佳的式 (I) 所示化合物之描述中所提及的較佳定義之化合物。因此，在製造式 (I) 所示化合物之本發明的方法 (a) 中用作為起始物之式 (II) 所示之經取代的雜芳基胼之 (R<sup>6</sup>)<sub>n</sub> 的定義亦較佳為上文有關本發明之式 (I) 所示化合物之描述中所提及之 (R<sup>6</sup>)<sub>n</sub> 的較佳定義，且特別佳的是根據基團 Het 義而變化。

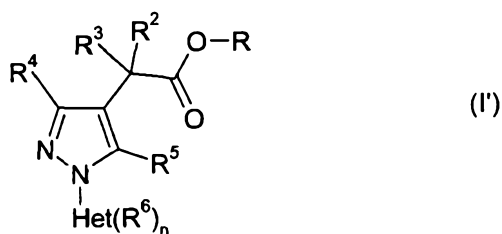
作為起始物之式 (II) 所示的胼或其鹽係為已知和 / 或可

利用已知的方法製得(參見, 例如 *Methoden der organischen Chemie* (Houben-Weyl, D. Klamann, Ed.) volume E16a, part 1, p. 421 ff., Georg Thieme Verlag, Stuttgart 1990 及其文中引用的文獻; *J. Am. Chem. Soc.*, **1954**, *76*, 596; *Monatshefte für Chemie* **1988**, *119*, 333; *J. Heterocyclic Chem.* **1988**, *25*, 1055; *J. Heterocyclic Chem.* **1989**, *26*, 475; *Heterocycles* **1994**, *37*, 379)。

式(II)和(III)之化合物的反應可在無觸媒或有觸媒(例如酸作為觸媒)的情況下, 較佳是於有機溶劑(例如四氫呋喃(THF)、二噁烷、乙腈、二甲基甲醯胺(DMF)、甲醇和乙醇), 在 20°C 至溶劑沸點的溫度(較佳是 50°C 至 150°C)之情況下進行。如果使用式(II)的酸加成鹽, 則其通常是藉助於而在當場釋出。適合的鹼或鹼性觸媒是鹼金屬氫氧化物、鹼金屬氫化物、鹼金屬碳酸鹽、鹼金屬碳酸氫鹽、鹼金屬烷醇鹽、鹼土金屬氫氧化物、鹼土金屬氫化物、鹼土金屬碳酸鹽, 或有機鹼(例如三乙胺、二異丙基乙胺或 1,8-二氮雜二環[5.4.0]十一碳-7-烯(DBU))。

類似的方法已揭示於文獻, 例如 WO 2004/037793。

(b) 如果式(I)中 R<sup>1</sup> 的不是氫, 則式(I')所示化合物



其中 Het、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  和  $R^6$  係如式 (I) 中所定義，及

$R$  是不同於基團  $R^1$  且不是氫之基團，係選自  $R^1$  中所定義之基團，或是式 (I') 中  $R = H$  的化合物之酸酐、醯鹵或活化酯，

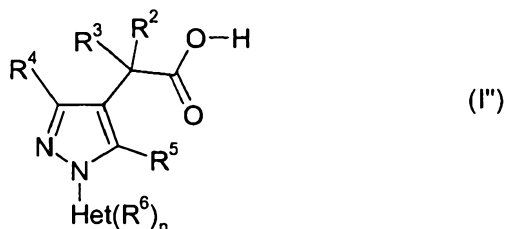
與式 (IV) 所示化合物反應，



其中  $R^1$  係如式 (I) 中所定義，

得式 (I) 所示化合物，或

(c) 如果式 (I) 中  $R^1$  的不是氫，則式 (I'') 所示化合物



其中 Het、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  和  $R^6$  係如式 (I) 中所定義，

適當的話，在活化酸基團後，與式(IV)所示化合物反應(酯化)，



其中  $R^1$  係如式(I)中所定義，

得式(I)所示化合物，或

(d) 如果要製造式(I)中  $R = H$  之化合物或其鹽，則水解式(I')所示化合物[參見變體(b)中的定義]，以得式(I)所示化合物或其鹽。

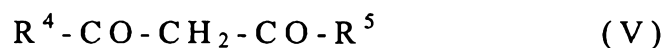
式(II)、(III)和(IV)之起始物通常是已知的，或可利用與已知方法類似的方法製造。

式(I')和(IV)化合物的反應可利用標準的轉酯化或酯化方法，經由活化的羧酸而進行。

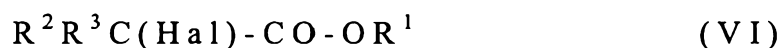
式(I'')和(IV)化合物的反應可利用標準的酯化方法，或適當的話經由活化的羧酸，而進行。

由化合物(I')製造式(I'')所示化合物可利用標準的水解方法而進行。

(e) 式(III)所示化合物可利用，例如，令式(V)所示之二羰基化合物



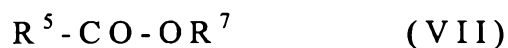
與式(VI)所示之化合物反應而製得，



其中  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  和  $R^5$  係如式(III)中所定義，且  $R^1$  較佳是甲基或乙基，及 Hal 是離去基，較佳是反應性鹵素，例如氯原子，或特別地為溴原子，或是對甲苯磺醯基(tosyl)或甲基磺醯基(mesyl)。

本發明之式(I)所示化合物可利用與上述之方法 a)至 e)類似的已知方法製造，例如 *Methoden der organischen Chemie* [Methods of Organic Chemistry] (Houben-Weyl, E. Schaumann, Ed.) volume E8b, Heterenes III, part 2, pp. 399-710, Georg Thieme Verlag, Stuttgart 1994 和文中引用的文獻所揭示者，其中根據下列文獻之合成方法是特別有興趣的：*Methoden der organischen Chemie* (Houben-Weyl, E. Schaumann, Ed.) volume E8b, Heterenes III, part 2, p. 420 ff., Georg Thieme Verlag, Stuttgart 1994 和文中引用的文獻；*Synthesis*, 1986, 409；*J. Chinese Chem. Soc.*, 2001, 48, 45，特別是 US 4146721、DE2141124、DOS 1946370 和 *Justus Liebigs Ann. Chem.* 1973, 1919。

(f) 式(V)的化合物可亦藉由，例如，令式(VII)所示化合物



與式(VIII)所示化合物，

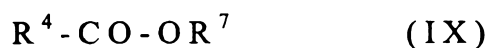


(其中  $R^4$  和  $R^5$  係如式(I)中所定義， $R^7$  是  $(C_1-C_6)$ -烷基，較佳是甲基或乙基)

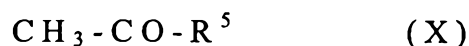
在適合的有機鹼(例如甲醇鈉或乙醇鈉)的存在下，於適合的溶劑(例如甲醇、乙醇，或較佳是四氫呋喃)中，在  $-10$  至  $50^\circ\text{C}$  的溫度下(較佳是  $0^\circ\text{C}$ )，及適當的話，在惰性氣體(例如氮氣)的氣氛下反應而製得。

與上述反應類似的反應已揭示於文獻，例如 *Supramolecular Chemistry* (2003), 15(7-8), 529-547 ; *J. Am. Chem. Soc.* (1951), 73 5614-16 ; *J. of Med. Chem.* (1990), 33(7), 1859-65 ; WO 00/08002。

或者，式(V)所示化合物可亦藉由令式(IX)所示化合物



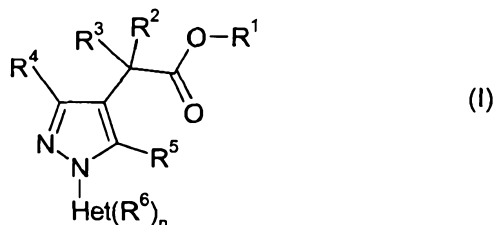
與式(X)所示化合物，



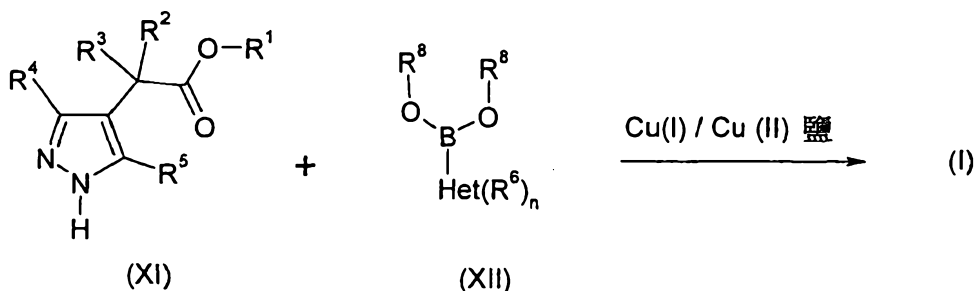
在類似於上述方法 f)所述之條件下進行反應而製得，  
其中  $\text{R}^4$  和  $\text{R}^5$  係如式 (I) 中所定義， $\text{R}^7$  是  $(\text{C}_1\text{-C}_6)$ -烷基，較佳是甲基或乙基。

與上述的反應類似的反應已揭示於文獻，例如 J. Am. Chem. Soc. (1950), 72 1352-6。

(g) 爲了製造通式 (I) 化合物，



其中  $\text{Het}$ 、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^5$  和  $\text{R}^6$  係如式 (I) 中所定義，例如，亦可令通式 (XI) 所示化合物與式 (XII) 所示的硼衍生物在適合的  $\text{Cu(I)}$  或  $\text{Cu(II)}$  鹽和有機鹼的存在下，適當的話於溶劑中，進行如下列反應圖所示之反應：



其中 Het、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  具有如上述式 (I) 中之定義，及  $R^8$  是 H 或 ( $C_1$ - $C_6$ )-烷基，較佳是甲基，或二個烷基  $R^8$  連結形成環。

反應係在適合的無機或有機銅 (I) 或銅 (II) 鹽 (較佳是 CuI、 $Cu_2O$ ，特別佳是  $Cu(OAc)_2$ ) 的存在下使用多於一個當量 (較佳是 1.5 至 2 當量) 之硼衍生物 (XII) 而進行。

為此目的，添加適合的有機鹼，例如吡啶或第三丁醇鉀，及為了使金屬轉移反應更有效率，添加氟陰離子源，較佳是氟化鈉。

反應係於適合的溶劑 (較佳是鹵化溶劑，例如三氯甲烷，或較佳的是二氯甲烷)，在 0 至  $40^\circ C$  (較佳是 20 至  $30^\circ C$ ) 的溫度下，及適當的話，在惰性氣體 (例如氮氣) 的氣氛下進行直到反應完全，某些情況可能需要長反應時間。

與銅-引發的 C-N 偶合反應類似的方法已揭示於文獻，例如 Tet. Lett. 1998, 39, 2941; Tet. Lett. 1998, 39, 2933; Tet. Lett. 44 (2003) 3863-3865; J. Comb. Chem. 2004, 6, 385-390; Tet. Lett. 41 (2000) 9053 to 9057。

與在氟陰離子的存在下之銅-引發的 C-N 偶合反應類似的方法已揭示於文獻，例如 Eur. J. Org. Chem. 2007, 1318-1323 和 Org. Lett. 2007, 9 (5), 761。

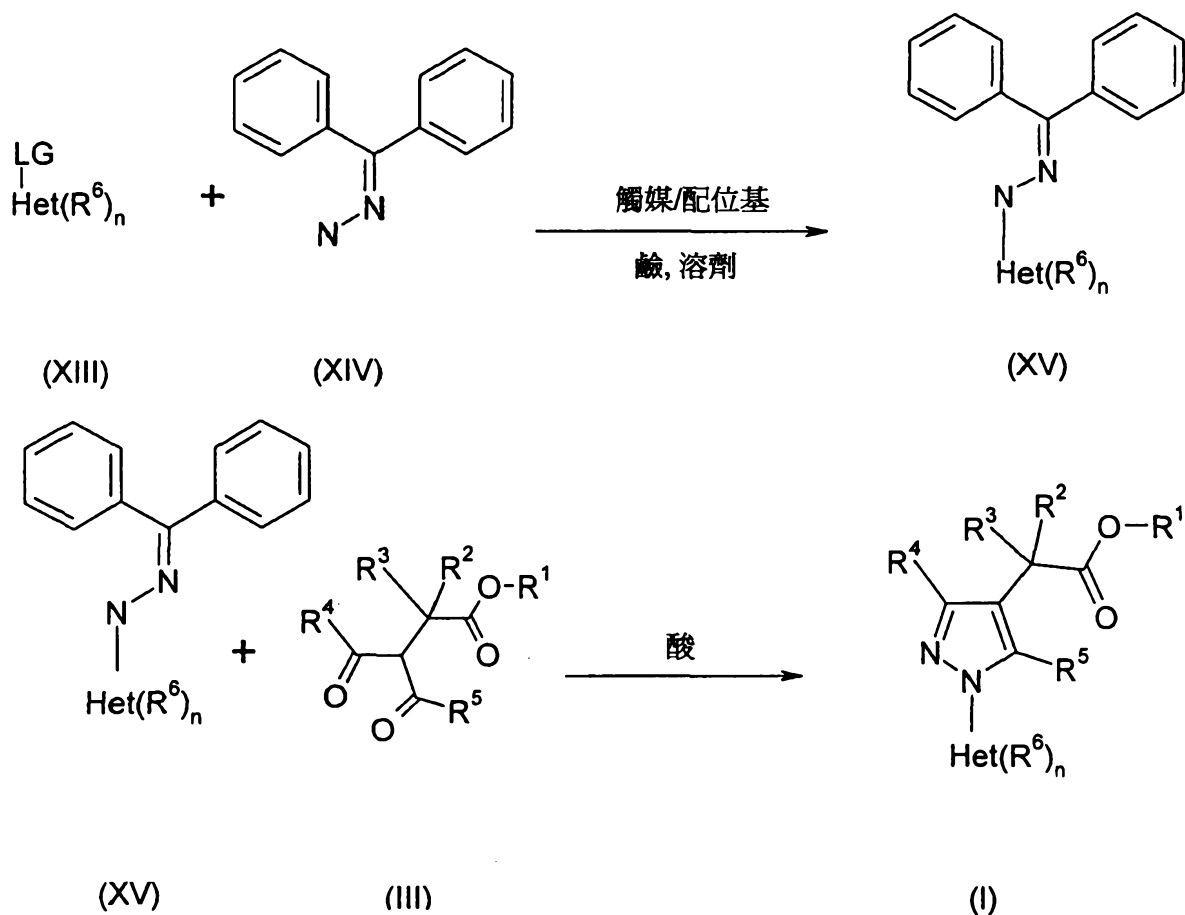
通式 (XI) 所示化合物可利用熟悉此項技術人士所習知的方法製造，例如令通式 (III) 所示化合物 (其中  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  和  $R^5$  係如式 (I) 中所定義) 與肼 (水合物) 反應，如

Can. J. Chem. 2001, 79 (2), 183-194 所述。

通式(XII)所示化合物已為熟悉此項技術人士所習知的，且部份是可由市面購得，或可由熟悉此項技術人士所習知的方法製得，根據例如下列文獻所述：a) Science of Synthesis, Houben-Weyl (Methods of Molecular Transformations), Category 2, Volume 6, Ed. E. Schaumann；b) Houben-Weyl (Methoden der organische Chemie [Methods of Organic Chemistry]), Volume 13, Organoborverbindungen [Organoboron Compounds] I-Part 3a, Ed. E. Schaumann。

(h) 用於製造上述之式(I)所示化合物之適合的起始物(其中 Het、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  和  $R^6$  係如式(I)中所定義)可亦為，例如，通式(XV)所示化合物，而其係藉由令式(XIII)所示化合物(其中  $R^6$  係如上述式(I)中之定義)與苯醌苯胺(XIV)在適合的觸媒/配位基系統及適合的鹼的存在下於適合的溶劑中進行反應而製得。

通式(XV)所示化合物與通式(III)所示化合物在酸的存在下，適當的話於溶劑中，得到通式(I)所示化合物，如下列反應圖所示：



其中，Het、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  係如上述式 (I) 中之定義，LG 是離去基，而適合的離去基尤其是氯、溴、碘、苯磺酸根、甲苯磺酸根和三氟甲磺酸根。

式 (XIII) 所示化合物可與苯醯苯胺 (XIV) 在觸媒和適合的觸媒/配位基系統的存在下反應而得式 (XV) 所示化合物。所述之反應較佳是在下列條件下進行：使用鈀觸媒，例如乙酸鈀 (II)，及使用磷配位基，例如 2,2'-雙(二苯膦基)-1,1'-聯萘 (BINAP)、1,1'-二苯膦基二茂鐵 (DPPF)、2-二-第三丁基膦基聯苯 (JohnPhos)、2-二環己基膦基-2'-二甲基胺基聯苯 (DavePhos)、2-二環己基膦基-2',4',6'-三異丙基聯苯 (XPhos)、2-二環己基膦基-2'-甲基聯苯 (MePhos)、4,5-

雙(二苯膦基)二苯並吡喃(XANTPHOS)。使用鹼(例如第三丁醇鈉)是有利的。所述之反應係在惰性氣體(例如氮氣)的氣氛下且排出水及於適合的溶劑(例如甲苯)中進行。

苯醯苯胺可由市面購得。

式(XV)所示化合物可直接進一步地與式(III)所示化合物反應而得式(I)所示化合物。此反應係在適合的無機或有機含水(或無水)酸(較佳是對甲苯磺酸、硫酸，特別佳是鹽酸)的存在下進行，其中使用1至10當量，特別佳是5當量的酸。

此反應係於適合的溶劑(例如二乙醚、二噁烷，或較佳是四氫呋喃)在0至80°C(較佳是50°C)的溫度下，及適當的話，在惰性氣體(例如氮氣)的氣氛下進行。

與胺和1,3-二酮之得到吡啶的環化反應相類似的反應已揭示於文獻，例如 WO2001/32627；Angew. Chem. 110 (1998) 2249-2252；Tet. Lett. 43 (2002) 2171-2173；J. Am. Chem. Soc. 1981, 103, 7743-7752；Organic Process Research and Development 2004, 8, 1065-1071；Tet. Lett. 45 (2004) 5935-5937；WO2007/064872；US 6489512；WO2006/114213。

式(XV)所示化合物可亦使用熟悉此項技術人士所習知的方法，在酸的存在下，較佳是在部份含水的條件下，轉換成式(II)所示化合物。式(II)所示化合物可進一步根據上述方法 a)進行反應而得式(I)所示化合物。

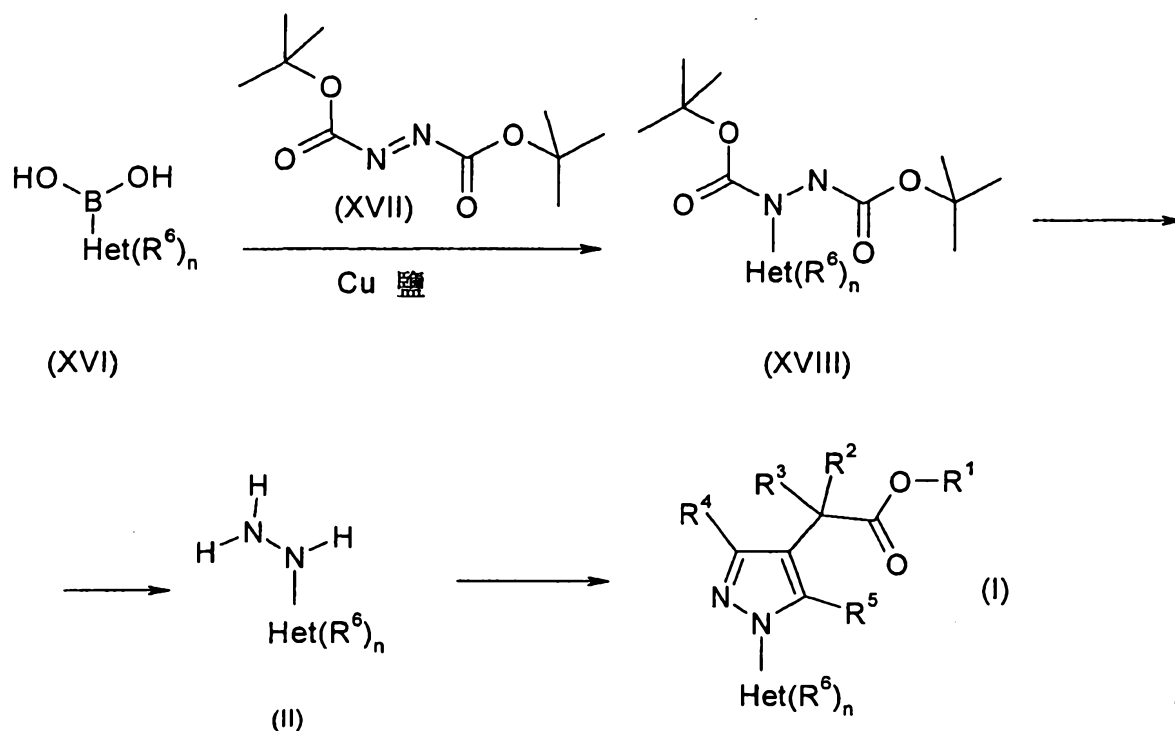
通式(XIII)所示化合物係為熟悉此項技術人士所習知

的，且部份是可由市面購得，或可由熟悉此項技術人士所習知的方法製得，例如根據 Science of Synthesis, Houben-Weyl (Methods of Molecular Transformations), Category 2, Volume 16, Ed. E. Schaumann 所述。

通式 (XV) 所示化合物可根據下列文獻所述而製造：例如，Tet. Lett. 45 (2004) 5935-5937；Angew. Chem. Int. Ed. 2006, 45, 6523-6527；J. Am. Chem. Soc. (2003) 125, 13978-13980；J. Am. Chem. Soc. (2003), 125, 6653-6655；Org. Lett. 3 (9) (2001) 1351；Tet. Lett. 45 (2004) 5935-5937；Tetr. Lett. 43 (2002) 2171-2173；Angew. Chem. Int. Ed. 1998, 37 (15) 2090；WO2001/32627；J. Am. Chem. Soc. (1998) 120, 6621；WO2007/064872；US 6489512；WO2006/114213；US2005/0192294；J. Am. Chem. Soc. 2003, 125, 6653-6655；Org. Lett. 2001, 3 (9), 1351-1354。

(i) 爲了製造上述之式 (I) 所示化合物 (其中 Het、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup> 和 R<sup>6</sup> 係如式 (I) 中所定義)，亦可能，例如，令通式 (XVI) 所示化合物 (其中 R<sup>6</sup> 係如式 (I) 中所定義) 與偶氮二羧酸二第三丁酯 (DBAD, XVII)，在適合的銅鹽的存在下，於適合的溶劑中反應，而得通式 (XVIII) 所示化合物 (其中 R<sup>6</sup> 係如式 (I) 中所定義)。此反應可得到式 (II) 所示化合物或其鹽 (其中 R<sup>6</sup> 係如式 (I) 中所定義)，而其可根據方法 a) 而轉換成式 (I) 所示化合物 (其中 R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>

、 $R^5$  和  $R^6$  係如式 (I) 中所定義)，如下列反應圖所示：



此反應係於例如下列的條件下進行：在適合的無機銅鹽 (例如  $\text{Cu}(\text{OAc})_2$  或  $\text{Cu}(\text{OAc})_2 \cdot \text{H}_2\text{O}$ ) 的存在下，於適合的溶劑 (例如醇，例如甲醇)，在 0 至  $40^\circ\text{C}$  (較佳是  $20 - 25^\circ\text{C}$ ) 的溫度範圍下，及適當的話，在惰性氣體 (例如氮氣) 的氣氛下。

使用市面購得的 (E)-偶氮 (diazene)-1,2-二羧酸二第三丁酯 (DTBAD) 之類似的反應已揭示於文獻，例如 *Org. Lett.* (2006) 8 (1), 43-45；*J. Org. Chem.* 2005, 70, 8631-8634。

通式 (XVI) 所示化合物可由市面購得和 / 或可由熟悉此項技術人士所習知的方法製得，例如根據下列文獻所述：

a) *Science of Synthesis, Houben-Weyl (Methods of*

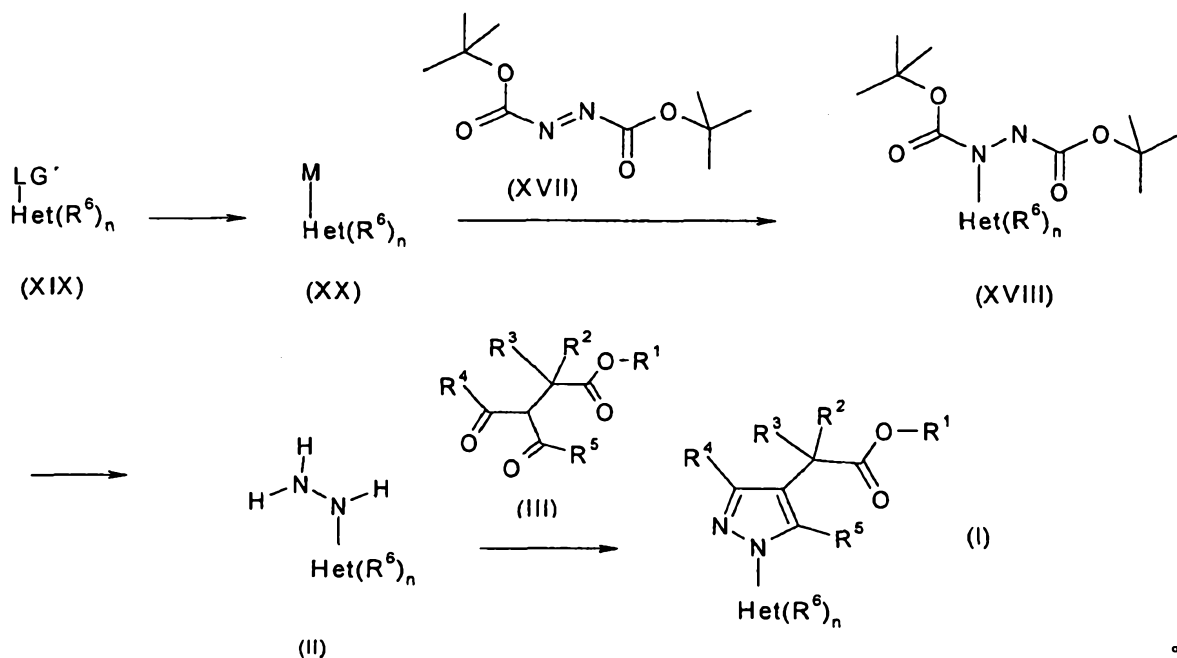
Molecular Transformations), Category 2, Volume 6, Ed. E. Schaumann ; b) Houben-Weyl (Methoden der organische Chemie [Methods of Organic Chemistry]), Volume 13, Organoborverbindungen [Organoboron Compounds] I-Part 3a, Ed. E. Schaumann .

通式 (XVIII) 所示化合物可利用熟悉此項技術人士所習知的方法而轉換成通式 (II) 所示化合物，例如根據 J. Med. Chem. 1998, 41, 2858-2871 ; Tetrahedron 44 (17), 5525 (1988) ; J. Med. Chem. 1996, 39, 1172-1188 ; J. Org. Chem. 2004, 69, 5778-5781 所述。

通式 (II) 所示化合物或其鹽可利用上述方法 a) 轉換成式 (I) 所示化合物。

(j) 爲了製造上述之式 (I) 所示化合物 (其中 Het、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  和  $R^6$  係如式 (I) 中所定義)，亦可能，例如，令通式 (XIX) 所示化合物 (其中  $R^6$  係如式 (I) 中所定義且 LG' 是適合的基團，其中該適合的基團尤其是硼和碘) 與適合的金屬或適合的金屬轉移劑反應而得式 (XX) 所示化合物，而式 (XX) 化合物本身與 (E)-偶氮-1,2-二羧酸二第三丁酯 (DTBAD, XVII) 在適合溶劑的存在下反應而得通式 (XVIII) 所示化合物 (其中  $R^6$  係如式 (I) 中所定義)。此反應得式 (II) 所示化合物或其鹽 (其中  $R^6$  係如式 (I) 中所定義)，而其根據方法 a) 可轉換成式 (I) 所示化合物 (其中  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  和  $R^6$  係如式 (I) 中所定義)，如下列反應圖所示

:



上述之轉換成通式 (XX) 所示化合物的反應係，例如，在適合的金屬轉移劑 (例如烷基鋰鹼，較佳是  $\text{BuLi}$ ；或金屬，較佳是  $\text{Li}$ 、 $\text{Mg}$  或  $\text{Zn}$ ) 的存在下進行。依此方法所形成的親核性基團進一步地與 (E)-偶氮-1,2-二羧酸二第三丁酯 (DTBAD, XVIII) 反應，得通式 (XVIII) 所示化合物。

使用市面購得的偶氮二羧酸二第三丁酯 (DBAD) 之類似的反應已揭示於文獻，例如 *Tet. Lett.* 1987, 28 (42), 4933; *Tet. Lett.* 39 (1998) 9157-9160。

通式 (XIX) 所示化合物可由市面購得和 / 或可由熟悉此項技術人士所習知的方法製得，例如根據 *Science of Synthesis, Houben-Weyl (Methods of Molecular Transformations), Category 2, Volume 16, Ed. E. Schaumann* 所述。

通式(XVIII)所示化合物可利用熟悉此項技術人士所習知的方法而轉換成通式(II)所示化合物，例如根據 *J. Med. Chem.* 1998, 41, 2858-2871 ; *Tetrahedron* 44 (17), 5525 (1988) ; *J. Med. Chem.* 1996, 39, 1172-1188 ; *J. Org. Chem.* 2004, 69, 5778-5781 所述。

通式(II)所示化合物或其鹽可利用上述方法 a)轉換成式(I)所示化合物。

通式(III)所示的起始物可經由一般習知的方法利用對應的 1,3-二酮與 2-鹵化的乙酸衍生物(例如溴乙酸衍生物)之烷基化反應而製得(參見，例如，DE-OS 1946370, p. 13)。  
作為此目的所需的起始物之 1,3-二酮(V)可利用上述方法 f)而製得，或可由市面購得，或為已知，和/或可由習知方法製得(參見，例如，US 4146721、DE2141124、DOS1946370 或 *J. Am. Chem. Soc.*, 1948, 70, 4023 ; *Justus Liebigs Ann. Chem.* 1973, 1919 ; *Justus Liebigs Ann. Chem.* 1976, 13 ; *J. Chem. Soc. Perkin Trans. 2*, 1993, 6, 1067 ; *Heteroatom Chemistry*, 1997, 8, 147)。

製造化合物(I)的鏡像異構物之方法亦可能是慣用的光學解析法(參見立體化學教科書)，例如在將混合物分離成非鏡像異構物的方法(例如物理方法，例如結晶、層析法(特別是管柱層析和高壓液相層析)、蒸餾(適當的話，在低壓下)、萃取和其他方法)之後，可以分離殘餘的鏡像異構物混合物，一般是利用在對掌性固相上進行層析分離。適合於製造量或工業規模之方法是，例如，使非鏡像異構鹽

進行結晶，而該非鏡像異構鹽係由化合物(I)利用光學活性酸(適當的話，如果存在有酸性基團時，則使用光學活性鹼)而得到。

適合於利用非鏡像異構鹽的結晶而進行光學解析之光學活性酸是，例如，樟腦磺酸、樟腦酸、溴樟腦磺酸、金雞納酸、酒石酸、二苯甲醯基酒石酸和其他類似的酸；適合之光學活性鹼是，例如，奎寧、金雞納鹼、奎寧啖、馬錢子鹼、1-苯基乙基胺和其他類似的鹼。

因此在大部份的情況中，接著於水性或水性-有機溶劑中進行結晶，其中較不溶的非鏡像異構物先沉澱出，適當的話在植入種晶之後。接著，由沉澱的鹽釋放出式(I)所示化合物之一種鏡像異構物，或利用酸化反應或使用鹼而由晶體釋出另一種鏡像異構物。

下列的酸是適合於製造式(I)所示化合物之酸加成鹽：氫鹵酸，例如鹽酸或氫溴酸，以及磷酸、硝酸、硫酸、單-或二官能基羧酸和羥基羧酸，例如乙酸、順丁烯二酸、琥珀酸、反丁烯二酸、酒石酸、檸檬酸、水楊酸、抗壞血酸、或乳酸、以及磺酸，例如對甲苯磺酸和1,5-萘二磺酸。式(I)所示之酸加成的化合物可由簡單的方法利用慣用之形成鹽的方法而製得，例如將式(I)所示化合物溶於適合的有機溶劑(例如甲醇、丙酮、二氯甲烷或苯)，及在0至100°C的溫度下添加酸，及以習知的方法(例如過濾)單離出鹽，及適當的話，以惰性有機溶劑沖洗而純化之。

式(I)所示化合物的鹼加成鹽較佳是於惰性極性溶劑(

例如，水、甲醇或丙酮)中在 0 至 100°C 的溫度下製造。適合於製備本發明的鹽之鹼的範例是鹼金屬碳酸鹽(例如碳酸鉀)、鹼金屬氫氧化物和鹼土金屬氫氧化物(例如 NaOH 或 KOH)、鹼金屬氫化物和鹼土金屬氫化物(例如 NaH)、鹼金屬醇鹽和鹼土金屬醇鹽(例如甲醇鈉或第三丁醇鉀)、或氨、乙醇胺或式  $[NRR'R''R''']^+OH^-$  所示之四級氫氧化銨。

“惰性溶劑”的定義意指於上述各種方法變體中在各個情況下之對特定反應條件為惰性但不必對所有反應條件為惰性的溶劑。

可由上述反應而合成得到且可亦由並行的方法製得之式 (I) 所示化合物和 / 或其鹽的收集可以手動方式或以部份或全部自動的方式進行。此時，例如，可能以自動的方式進行反應、收拾或純化產物或中間物的步驟。總體而言，此種情況可藉由，例如，D. Tiebes 於 *Combinatorial Chemistry - Synthesis, Analysis, Screening* (Editor Günther Jung), Wiley 1999, pages 1 to 34 所述的步驟而明白。

許多可由市面購得的設備可用於平行反應步驟和純化處理，例如可使用購自 Barnstead International, Dubuque, Iowa 52004-0797, USA 的 Calpyso 反應槽，或購自 Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, CB 11 3AZ, England 的反應站，或購自 Perkin Elmar, Waltham, Massachusetts 02451, USA 的 MultiPROBE Automated

Workstations (自動化工作站)。特別是，例如，購自 ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA 的層析設備，可用於式(I)所示化合物及其鹽或製備期間所產生的中間物之平行純化。

所列示的設備可得到模組化的步驟，其中個別的操作步驟是自動化的，但在各個操作步驟之間則必須進行手動操作。此可藉由使用部份或全部整合的自動化系統而進行，其中相關的自動化模組係藉由例如自動控制裝置加以操作。此自動化系統可得自例如 Caliper, Hopkinton, MA 01748, USA。

個別合成步驟或數個合成步驟之執行可藉助於利用經聚合物支撐的試劑/清除劑樹脂。專家的文獻描述一系列實驗流程，例如 ChemFiles, Vol. 4, No. 1, Polymer-Supported Scavengers and Reagents for Solution-Phase Synthesis (Sigma-Aldrich)。

除了文中所描述的方法之外，式(I)所示化合物和其鹽之合成可完全或部份利用固相支撐的方法進行。為此目的，合成或配合於相關步驟的合成之個別的中間物或所有的中間物係與合成樹脂結合。固相支撐的合成方法充份地揭示於專家文獻，例如 Barry A. Bunin 之 “The Combinatorial Index”, Academic Press, 1998 和 Combinatorial Chemistry – Synthesis, Analysis, Screening (Editor Günther Jung), Wiley, 1999。利用固相支撐的合成方法允許以手動或自動的方式進行一系列之文獻已知的流

程。例如，反應可利用 IRORI 技術於購自 Nexus Biosystem, 12140 Community Road, Poway, CA92064, USA 的微反應器中進行。

於固相和液相二者中進行的個別合成步驟或數個合成步驟均可藉助於微波技術。一系列實驗流程揭示於專家文獻，例如 *Microwaves in Organic and Medicinal Chemistry* (Editors C. O. Kappe and A. Stadler), Wiley, 2005。

利用本文所揭示的製造方法提供可得到大量之式(I)所示化合物和其鹽(統稱為資料庫)。本發明因而亦提供含有至少二種式(I)所示化合物和/或其鹽之資料庫。

本發明之式(I)所示化合物和/或其鹽，下文中統稱為“本發明之化合物(I)”或簡稱為“化合物(I)”，對廣泛範圍之經濟上重要的單子葉和雙子葉一年生有害植物具有優異的除草活性。此活性化合物亦有效於由地下莖、根莖或其他多年生有機物發芽且難以防治之多年生有害植物。

本發明因此亦有關於一種防治非所欲的植物或調節植物生長(較佳是於植物的作物中)之方法，其中一或多種本發明之化合物係應用於植物(例如有害植物，例如單子葉或雙子葉雜草或非所欲的作物)、種子(例如穀物、種子或無性繁殖體，例如有芽塊莖或幼枝部份)、或植物生長的區域(例如耕種的區域)。關於此點，本發明之化合物可在例如種植前(適當的話亦混入土壤內)、萌芽前或萌芽後應用。可為本發明之化合物所防治的單子葉和雙子葉雜草植物群之代表範例分別如下所述，但決不用於限制至特定物種

。

包含下列屬之單子葉有害植物：山羊草屬 (*Aegilops*)、鵝觀草屬 (*Agropyron*)、剪股穎屬 (*Agrostis*)、看麥娘屬 (*Alopecurus*)、阿披拉草屬 (*Apera*)、燕麥屬 (*Avena*)、臂形草屬 (*Brachicaria*)、雀麥屬 (*Bromus*)、蒺藜草屬 (*Cenchrus*)、鴨跖草屬 (*Commelina*)、狗牙根屬 (*Cynodon*)、莎草屬 (*Cyperus*)、龍爪茅屬 (*Dactyloctenium*)、馬唐屬 (*Digitaria*)、稗屬 (*Echinochloa*)、荸薺屬 (*Eleocharis*)、稭屬 (*Eleusine*)、畫眉草屬 (*Eragrostis*)、野黍屬 (*Eriochloa*)、羊茅屬 (*Festuca*)、細裂花柱 (*Fimbristylis*)、異蕊花屬 (*Heteranthera*)、白茅屬 (*Imperata*)、鴨嘴草屬 (*Ischaemum*)、千金子屬 (*Leptochloa*)、黑麥草屬 (*Lolium*)、鴨舌草屬 (*Monochoria*)、黍屬 (*Panicum*)、雀稗屬 (*Paspalum*)、鵲草屬 (*Phalaris*)、梯牧草屬 (*Phleum*)、早熟禾屬 (*Poa*)、羅氏草屬 (*Rottboellia*)、慈姑屬 (*Sagittaria*)、莞屬 (*Scirpus*)、狗尾草屬 (*Setaria*)、蜀黍屬 (*Sorghum*)。

包含下列屬之雙子葉雜草：苘麻屬 (*Abutilon*)、莧屬 (*Amaranthus*)、豬草 (*Ambrosia*)、油桐屬 (*Anoda*)、春黃菊屬 (*Anthemis*)、山洋芹屬 (*Aphanes*)、艾屬 (*Artemisia*)、濱藜屬 (*Atriplex*)、雛菊屬 (*Bellis*)、鬼針草屬 (*Bidens*)、薺屬 (*Capsella*)、大薊屬 (*Carduus*)、決明屬 (*Cassia*)、矢車菊屬 (*Centaurea*)、藜屬 (*Chenopodium*)、薊屬 (*Cirsium*)、三色牽牛屬 (*Convolvulus*)、曼陀羅屬 (*Datura*)、山螞蝗屬 (*Desmodium*)、刺酸模屬 (*Emex*)、糖芥屬 (*Erysimum*)、大

戟屬 (Euphorbia)、 鮑瓣花屬 (Galeopsis)、 小米菊屬 (Galinsoga)、 豬殃殃屬 (Galium)、 木槿屬 (Hibiscus)、 番薯屬 (Ipomoea)、 地膚屬 (Kochia)、 野芝麻屬 (Lamium)、 獨行菜屬 (Lepidium)、 鈎樟屬 (Lindernia)、 香菊屬 (Matricaria)、 薄荷屬 (Mentha)、 山靛屬 (Mercurialis)、 粟米草屬 (Mullugo)、 毋忘我屬 (Myosotis)、 罌粟屬 (Papaver)、 牽牛花屬 (Pharbitis)、 車前草屬 (Plantago)、 蓼屬 (Polygonum)、 馬齒莧屬 (Portulaca)、 毛茛屬 (Ranunculus)、 萊服屬 (Raphanus)、 蔞菜屬 (Rorippa)、 節節菜屬 (Rotala)、 酸模屬 (Rumex)、 豬毛菜屬 (Salsola)、 劉寄奴屬 (Senecio)、 田菁屬 (Sesbania)、 黃花稔屬 (Sida)、 芥屬 (Sinapis)、 茄屬 (Solanum)、 苦苣菜屬 (Sonchus)、 尖瓣花屬 (Sphenoclea)、 繁縷屬 (Stellaria)、 蒲公英屬 (Taraxacum)、 苜蓿屬 (Thlaspi)、 三葉草屬 (Trifolium)、 蕁麻屬 (Urtica)、 鹹蝦花屬 (Veronica)、 堇菜屬 (Viola)、 蒼耳屬 (Xanthium)。

如果本發明之化合物係在萌芽之前應用於固體表面，則可完全防止雜草幼苗的萌芽，或者雜草生長直到其達到子葉期，但是之後生長停止，且最後在經過 3 至 4 週後完全死亡。

當活性化合物在萌芽後施用至綠色植物部份時，在處理後生長停止，而有害植物仍保持在施用時的生長階段或在一段時間後完全死亡，使得對作物有害的雜草之競爭及時在早期被終止且持續地被終止。

雖然本發明之化合物對單子葉和雙子葉雜草顯示優異

的除草活性，但是對經濟上重要的作物(例如雙子葉作物：蔓花生屬(*Arachis*)、甜菜屬(*Beta*)、蕓苔屬(*Brassica*)、甜瓜屬(*Cucumis*)、南瓜屬(*Cucurbita*)、向日葵(*Helianthus*)、胡蘿蔔屬(*Daucus*)、大豆屬(*Glycine*)、棉屬(*Gossypium*)、番薯屬(*Ipomoea*)、萵苣屬(*Lactuca*)、亞麻屬(*Linum*)、番茄屬(*Lycopersicon*)、五節芒屬(*Miscanthus*)、煙草屬(*Nicotiana*)、菜豆屬(*Phaseolus*)、豌豆屬(*Pisum*)、茄屬(*Solanum*)、蠶豆屬(*Vicia*)；或單子葉作物：蔥屬(*Allium*)、鳳梨屬(*Ananas*)、天門冬屬(*Asparagus*)、燕麥屬(*Avena*)、大麥屬(*Hordeum*)、稻屬(*Oryza*)、黍屬(*Panicum*)、甘蔗屬(*Saccharum*)、黑麥屬(*Secale*)、高粱屬(*Sorghum*)、黑小麥屬(*Triticale*)、小麥屬(*Triticum*)、玉蜀黍屬(*Zea*)，特別是玉蜀黍屬(*Zea*)和小麥屬(*Triticum*)，只顯現微小程度的損害或完全無損害，決定於本發明之個別化合物的結構及其施用比率。此即是為何本發明化合物高度適合於選擇性防治作物(例如農業上有用的植物或觀賞植物)中之非所欲的植物的生長之理由。

此外，本發明之化合物(決定於其個別的結構及施用比率)對作物具有優異的生長調節性質。其以調節的方式參與植物的代謝，因此可以用於以所欲的方式影響植物組成，及，例如，藉由觸發乾燥和生長萎縮的方式而有利於收成。此外，其亦適合於一般性地防治和抑制非所欲的植物生長而不會損傷本發明方法中的植物。抑制植物生長於許多單子葉和雙子葉作物中扮演著重要的角色，因為例如

可以減少倒伏，或因而完全防止倒伏。

由於其除草性和植物生長調節性，所述之活性化合物可亦用於防治基因改良的植物或已經利用傳統突變方法改良的植物之作物中的有害植物。因此，基因轉植的植物因一些特別有利的性質而顯著，例如對特定農藥(主要是一些除草劑)的抗性、對植物疾病或植物疾病的致病生物之抗性，例如一些昆蟲或微生物，例如黴菌、細菌或病毒。其他特別的性質是關於，例如，收成的物質之產量、品質、貯存性、組成和特殊的組份。因此，具有較高的澱粉含量或改良的澱粉品質之基因轉植的植物，或收成的物質具有不同的脂肪酸組成之基因轉植的植物係為已知的。

關於基因轉植作物，較佳的是使用本發明之化合物於有用植物和觀賞植物之經濟上重要的基因轉植作物，例如穀物，例如小麥、大麥、裸麥、燕麥、高粱和小米、稻米和玉米，或是甜菜、棉花、大豆、芸苔、馬鈴薯、蕃茄、豌豆和其他蔬菜之作物。

較佳的是利用本發明之化合物作為對除草劑植物毒性具有抗性或已經利用重組合的方式使具有抗性之有用植物的作物之除草劑。

由於其除草性和植物生長調節性，所述之活性化合物可亦用於防治已知的基因改良植物或仍在發展中的基因改良植物之作物中的有害植物。因此，基因轉植的植物因一些特別有利的性質而顯著，例如對特定農藥(主要是一些除草劑)的抗性、對植物疾病或植物疾病的致病生物之抗

性，例如一些昆蟲或微生物，例如黴菌、細菌或病毒。其他特別的性質是關於，例如，收成的物質之產量、品質、貯存性、組成和特殊的組份。因此，具有較高的澱粉含量或改良的澱粉品質之基因轉植的植物，或收成的物質具有不同的脂肪酸組成之基因轉植的植物係為已知的。其他特殊的性質可為對無生命的應力來源(例如熱、冷、乾旱、鹽和紫外光輻射)之耐受性或抗性。

較佳的是使用本發明之式(I)所示化合物或其鹽於有用植物和觀賞植物之經濟上重要的基因轉植作物，例如穀物，例如小麥、大麥、裸麥、燕麥、高粱和小米、稻米、木薯和玉米，或是甜菜、棉花、大豆、芸苔、馬鈴薯、蕃茄、豌豆和其他蔬菜之作物。

較佳的是利用式(I)所示化合物和/或其鹽作為對除草劑植物毒性具有抗性或已經利用重組合的方式使具有抗性之有用植物的作物之除草劑。

傳統之產生新穎植物(相較於現有植物具有改良的性質)之方法是，例如，傳統的育種方法和突變種的產生。或者，具有改良的性質之新穎植物可利用重組合的方式產生(參見，例如，EP-A-0221044，EP-A-0131624)。例如，下列的情況已被揭示：

- 一 為了改良植物所合成的澱粉之目的而對作物進行重組合改良(例如 WO 92/11376，WO 92/14827，WO 91/19806)，
- 一 對一些固殺草(glufosinate)類除草劑(參考，例如，

- EP-A-0242236，EP-A-242246)或嘉磷塞(glyphosate)類除草劑(WO 92/00377)或磺醯基脲類除草劑(EP-A-0257993，US-A-5013659)具有抗性之基因轉植作物，
- 可以產生蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)毒素(Bt 毒素)而使植物對一些害蟲具有抗性之基因轉植作物，例如棉花(EP-A-0142924，EP-A-0193259)，
  - 具有改良的脂肪酸組成之基因轉植作物(WO 91/13972)，
  - 具有新穎構份或二次代謝物(例如新穎的植物防禦素(phytoalexins))之基因改良的作物，可提高抗疾病性(EPA 309862，EPA0464461)，
  - 光呼吸作用減低之基因改良的植物，具有較高的產率和較高的應力耐受性(EPA 0305398)，
  - 可生產藥學或診斷上重要的蛋白質之基因轉植作物(“分子牧場(molecular pharming)”)，
  - 以較高產率或較佳品質為特徵之基因轉植作物，
  - 以例如上述新穎性質的組合為特徵之基因轉植作物(“基因堆疊(gene stacking)”)。

可用以產生具有改良性質之新穎的基因轉植植物之許多分子生物技術原則上是已知的；參見，例如，I. Potrykus and G. Spangenberg (eds.) *Gene Transfer to Plants*, Springer Lab Manual (1995), Springer Verlag Berlin, Heidelberg. or Christou, “Trends in Plant Science”

1 (1996) 423-431)。

爲了進行此類重組技術的操作，可以將核酸分子導入質體內，使可利用 DNA 序列的重組而產生突變或序列修飾。例如，利用標準方法可進行鹼基取代，可除去部份序列，或可加入天然或合成的序列。爲使 DNA 片斷彼此連結，可於該片斷中加上轉接子或連接子；參見，例如，Sambrook et al., 1989, *Molecular Cloning, A Laboratory Manual*, 2nd ed., Cold Spring Harbor Laboratory Press, Cold Spring Harbor, NY；或 Winnacker “Gene und Klone [Genes and Clones]”, VCH Weinheim 2nd ed., 1996。

具有減低活性之植物細胞的基因產物可利用下列而生成：例如，表現至少一種對應的反義 RNA、有義 RNA 以達到共抑制作用，或表現至少一種以專一性地裂斷上述基因產物的轉錄體之對應的建構的核糖酵素(ribozyme)。

爲此，可能首先使用 DNA 分子，其包含基因產物之所有編碼序列(包含可能存在之任何側翼序列)，或是只包含編碼序列的一部份之 DNA 分子(這些部份必須夠長以在細胞內產生反義作用)。亦可能使用與基因產物的編碼序列具有高度同源性但不完全相同之 DNA 序列。

當於植物內表現核酸分子時，所合成的蛋白質可定位於植物細胞之任何隔室。然而，爲了使定位於特定隔室，例如，可以將編碼區連結至確保定位於特定隔室的 DNA 序列。此種序列係爲熟悉該項技術者所習知(參見，例如，Braun et al., *EMBO J.* 11 (1992), 3219-3227；Wolter et

al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 85 (1988), 846-850 ;  
Sonnewald et al., Plant J. 1 (1991), 95-106)。核酸分子可  
亦表現於植物細胞的細胞器內。

基因轉植的植物細胞可利用習知技術再生而得到完整的植物。原則上，基因轉植的植物可為任何植物品種的植物，即為單子葉和雙子葉植物二者。

因此，可以得到以修飾的性質為特徵之基因轉植的植物，而該修飾的性質係由於同源(=天然)基因或基因序列之過度表現、減少或抑制，或異源(=外來)基因或基因序列之表現所致。

較佳的是使用本發明之化合物(I)於下列基因轉植作物：對例如麥草畏(dicamba)的生長調節劑具有抗性之基因轉植作物，或對可抑制基本植物酵素(例如乙醯乳酸合成酶(ALS)、EPSP合成酶、麩醯胺合成酶(GS)或羥基苯基丙酮酸二氧合酶(HPPD))的除草劑具有抗性之基因轉植作物，或對選自磺醯基脲、嘉磷塞(glyphosate)、固殺草(glufosinate)或苯甲醯基異噁唑和類似活性化合物的除草劑具有抗性之基因轉植作物。

當本發明之活性化合物應用於基因轉植作物時，除了於其他作物所觀察到之對有害植物的作用之外，通常亦會發生針對施用於特定基因轉植作物時所特有的作用，例如可被防治的雜草範圍被改變或特別擴大，應用時所用的施用比率改變，較佳是與基因轉植作物產生抗性的除草劑之組合性良好，及影響基因轉植作物的生長和產量。

本發明因此亦有關於使用本發明之式(I)所示化合物和/或其鹽作為除草劑於防治基因轉植作物中之有害植物。

本發明之防治有害植物或調節植物生長的用途亦包含式(I)所示活性化合物或其鹽不是由前驅物質(“前驅藥物”)合成，而是直到應用於植物上、植物內或土壤內之後才被合成出的情況。

本發明之化合物(I)可以可潤濕性粉末、可乳化的濃縮液、可噴灑的溶液、粉劑或粒劑之形態的傳統製劑使用。本發明因此亦有關於包含式(I)所示化合物和/或其鹽之除草性和植物生長調節性組成物。

式(I)所示化合物和/或其鹽可以各種方式根據所需的生物和/或物理化學參數而調配。可能的調合物包含，例如：可潤濕性粉末(WP)、水溶性粉末(SP)、水溶性濃縮液、可乳化的濃縮液(EC)、乳化液(EW)(例如水包油和油包水乳化液)、可噴灑的溶液、懸浮濃縮液(SC)、油基或水基的分散液、油混溶的溶液、膠囊懸浮液(CS)、撒粉式產品(DP)、拌種型(seed-dressing)產品、播撒和土壤應用之粒劑、呈微粒劑、噴灑粒劑、塗覆的粒劑和吸附粒劑形態之粒劑(GR)、水分散性粒劑(WG)、水溶性粒劑(SG)、ULV調合物、微膠囊和蠟。

這些個別的調合物類型原則上係為已知，且已揭示於，例如：Winnacker-Küchler, “Chemische Technologie” [Chemical technology], Volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th Ed. 1986, Wade van Valkenburg, “Pesticide

Formulations”, Marcel Dekker, N.Y., 1973 ; K. Martens, “Spray Drying” Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London。

所需的調合助劑，例如惰性物質、表面活性劑、溶劑和其他添加劑，亦是已知且揭示於，例如：Watkins, “Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers”, 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, “Introduction to Clay Colloid Chemistry” ; 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y. ; C. Marsden, “Solvents Guide” ; 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963 ; McCutcheon’s “Detergents and Emulsifiers Annual”, MC Publ. Corp., Ridgewood N.J. ; Sisley and Wood, “Encyclopedia of Surface Active Agents”, Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964 ; Schönfeldt, “Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte” [Interface-active ethylene oxide adducts], Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1976 ; Winnacker-Küchler, “Chemische Technologie” [Chemical technology], volume 7, C. Hanser Verlag Munich, 4th Ed. 1986。

可潤濕性粉末是可均勻分散於水中之製劑，且除了活性物質以外，亦包含離子性和/或非離子性表面活性劑(潤濕劑、分散劑)，例如聚乙氧基化的烷基酚、聚乙氧基化的脂肪醇、聚乙氧基化的脂肪胺、脂肪醇聚乙二醇醚硫酸鹽、烷磺酸鹽、烷基苯磺酸鹽、木質磺酸鈉、2,2’-二萘基甲烷-6,6’-二磺酸鈉、二丁基萘磺酸鈉或是油醯基甲基牛

磺酸鈉，以及稀釋劑或惰性物質。爲了製備可潤濕性粉末，除草活性物質與調合助劑例如於慣用的設備(例如錘磨機、鼓風研磨機和噴射研磨機)中同時或先後研磨成細粉並混合。

可乳化的濃縮液係藉由將活性物質溶於有機溶劑(例如丁醇、環己酮、二甲基甲醯胺、二甲苯、或高沸點芳族化合物或烴類)或有機溶劑的混合物中且同時添加一或多種離子性和/或非離子性表面活性劑(乳化劑)而製備。可使用的乳化劑之範例是：烷基芳基磺酸鈣，例如十二烷基苯磺酸鈣；或非離子性乳化劑，例如脂肪酸聚乙二醇酯、烷基芳基聚乙二醇醚、脂肪醇聚乙二醇醚、環氧丙烷/環氧乙烷縮合物、烷基聚醚、山梨糖醇酐酯(例如山梨糖醇酐脂肪酸酯)或聚氧乙烯山梨糖醇酐酯(例如聚氧乙烯山梨糖醇酐脂肪酸酯)。

粉劑係藉由將活性物質與細分的固體材料(例如，滑石、天然黏土例如高嶺土、膨潤土和葉蠟石、或矽藻土)一起研磨而得到。

懸浮濃縮液可爲水基或油基的。其可例如利用市面上購得的珠磨機，適當的話，添加表面活性劑(例如在上文中之其他調合物類型所揭示者)，以濕式研磨的方式製備。乳化液，例如水包油乳化液(EW)，可例如利用攪拌器、膠體研磨機和/或靜態混合機，使用水性有機溶劑，及適當的話，表面活性劑(例如在上文中之其他調合物類型所揭示者)而製備。

粒劑可藉由將活性物質噴灑於吸附性粒狀惰性物質上或將活性物質濃縮液藉助於黏著劑(例如聚乙烯醇、聚丙烯酸鈉或礦油)而應用於載體(例如沙、高嶺土或粒狀惰性物質)的表面上而製備。適合的活性物質可亦以製備肥料粒劑時慣用的方式粒化，必要時為與肥料之混合物的形態。

水可散的粒劑通常係由下列慣用的方法而製備：例如，噴灑乾燥、流化床粒化法、盤式粒化法、利用高速攪拌器的混合、及無固體惰性物質的擠壓法。關於製備盤式粒劑、流化床粒劑、擠壓粒劑和噴灑粒劑，請參見，例如，下列文獻所揭示的方法：“Spray-Drying Handbook” 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London；J.E. Browning, “Agglomeration”, Chemical and Engineering 1967, pages 147 et seq.；“Perry’s Chemical Engineer’s Handbook”, 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, p. 8-57。

作物保護產品之調配的其他細節參見，例如，G.C. Klingman, “Weed Control as a Science”, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pages 81-96 and J.D. Freyer, S.A. Evans, “Weed Control Handbook”, 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, pages 101-103。

農化調合物通常含有 0.1 至 99 重量%，特別是 0.1 至 95 重量%之式(I)所示活性化合物和/或其鹽。

可潤濕性粉末中，活性化合物的濃度是，例如，約 10 至 90 重量%；其餘至 100 重量%者係由慣用的調合物構

份所組成。在可乳化的濃縮液的情況，活性化合物的濃度可為約 1 至 90 重量%，較佳是 5 至 80 重量%。粉劑型調合物含有 1 至 30 重量%活性化合物，通常較佳是 5 至 20 重量%活性化合物；可噴灑的溶液含有約 0.05 至 80 重量%，較佳是 2 至 50 重量%活性化合物。水可散的粒劑中，活性化合物含量部份決定於活性化合物是否以固體或液體形態存在及所用的粒化助劑、填料等。在可分散於水的粒劑中，活性化合物的含量是，例如，1 至 95 重量%，較佳是 10 至 80 重量%。

此外，所述之活性化合物調合物任意地包括個別慣用的黏合劑、潤濕劑、分散劑、乳化劑、滲透劑、防腐劑、抗凍劑和溶劑、填料、載劑和染料、消泡劑、揮發抑制劑及影響 pH 和黏度的試劑。調合助劑的範例特別揭示於“Chemistry and Technology of Agrochemical Formulations”，ed. D.A. Knowles, Kluwer Academic Publishers (1998)。

式(I)所示化合物或其鹽可以本身的形態使用或以其與其他農藥上的活性物質(例如殺昆蟲劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、除草劑、殺菌劑、安全劑、肥料和/或生長調節劑)組合形成的製劑(調合物)之形態使用，例如以最終調合物或槽混合物的形態使用。所述之組合調合物可以上述調合物為基礎且同時考量所欲組合之活性化合物的物理性質和安定性而製備。

可與本發明化合物以混合調合物或槽混合物的形態一

起使用之活性物質是，例如，基於抑制下列的作用之已知活性物質：例如，乙醯乳酸合成酶、乙醯基-CoA 羧化酶、纖維素合成酶、烯醇丙酮酸莽草酸-3-磷酸(enolpyruvylshikimate-3-phosphate)合成酶、麩醯胺合成酶、對羥基苯基丙酮酸二氧合酶、八氫番茄紅素去飽和酶(phytoen desaturase)、光合系統 I、光合系統 II、卟啉原氧化酶(protoporphyrinogen oxidase)，例如，如 Weed Research 26 (1986) 441-445 或 “The Pesticide Manual”, 14th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 2003 及其中引用的文獻所揭示。可與本發明化合物併用之已知的除草劑或植物生長調節劑是，例如，下列活性物質(化合物係以根據 International Organization for Standardization (ISO)的常用名稱或化學名稱或代號表示)，且總是包含所有的使用形態例如酸、鹽、酯和異構物(例如立體異構物和光學異構物)。因此，以例舉的方式說明該化合物之一種形態及在某些情況亦為數種使用形態：

阿西可羅(acetochlor)、苯並噻二唑(acibenzolar)、苯並噻二唑-S-甲基(acibenzolar-S-methyl)、亞喜芬(acifluorfen)、亞喜芬鈉(acifluorfen-sodium)、阿克羅尼芬(aclonifen)、拉草(alachlor)、二丙烯草胺(allidochlor)、亞汰草(alloxydim)、亞汰草鈉(alloxydim-sodium)、草殺淨(amestryne)、阿米卡巴諾(amicarbazone)、呋喃丹(amidochlor)、醯嘧磺隆(amidosulfuron)、胺比立氫

(aminocyclopyrachlor)、胺比立(aminopyralid)、殺草強(amitrole)、胺基磺酸銨(ammonium sulfamate)、環丙嘧啶醇(ancymidol)、阿尼羅弗斯(anilofos)、亞速爛(asulam)、草脫淨(atrazine)、阿扎芬尼地(azafenidin)、四唑嘧磺隆(azimsulfuron)、滅蘇民(aziprotryne)、BAH-043、BAS-140H、BAS-693H、BAS-714H、BAS-762H、BAS-776H、BAS-800H、氟丁草胺(beflubutamid)、苯諾立(benazolin)、苯諾立-乙基(benazolin-ethyl)、苯卡隆(bencarbazone)、倍尼芬(benfluralin)、苯福瑞沙特(benfuresate)、苯殺立(bensulide)、苄嘧磺隆-甲基(bensulfuron-methyl)、本達隆(bentazone)、雙苯嘧草酮(benzfendizone)、苯並雙環酮(benzobicyclon)、草酮(benzofenap)、苯諾福拉爾(benzofluor)、苯諾普諾(benzoylprop)、必芬諾(bifenox)、畢拉草(bilanafos)、畢拉草鈉(bilanafos-sodium)、必斯拜立巴(bispyribac)、必斯拜立巴-鈉(bispyribac-sodium)、克草(bromacil)、伯羅布替(bromobutide)、伯羅諾芬斯(bromofenoxim)、溴苯腈(bromoxynil)、溴米隆(bromuron)、布米拉氟(buminafos)、羥草酮(busoxinone)、丁基拉草(butachlor)、氟丙嘧草酯(butafenacil)、布米那弗斯(butamifos)、布替那克羅(butenachlor)、比達寧(butralin)、布秋斯地(butroxydim)、拔敵草(butylate)、卡芬斯唑(cafenstrole)、卡貝他醯胺(carbetamide)、卡芬座(carfentrazone)、卡芬座-乙基(carfentrazone-ethyl)、甲氧基護谷(chlomethoxyfen)、氯氨苯甲酸(chloramben)、氯拉

立弗 (chlorazifop)、氯拉立弗-丁基 (chlorazifop-butyl)、克布隆 (chlorbromuron)、氯布伐 (chlorbufam)、伐草克 (chlorfenac)、伐草克-鈉 (chlorfenac-sodium)、克凡派 (chlorfenprop)、氯甲丹 (chlorflurenol)、氯甲丹-甲基 (chlorflurenol-methyl)、殺草敏 (chloridazon)、氯嘧磺隆 (chlorimuron)、氯嘧磺隆-乙基 (chlorimuron-ethyl)、氯化矮壯素 (chlormequat-chloride)、氯硝芬 (chlornitrofen)、氯太克 (chlorophthalim)、氯酞酸二甲酯 (chlorthal-dimethyl)、綠麥隆 (chlorotoluron)、氯磺隆 (chlorsulfuron)、西尼多 (cinidon)、西尼多-乙基 (cinidon-ethyl)、辛美雪靈 (cinmethylin)、醚磺隆 (cinosulfuron)、剋草同 (clethodim)、托比克 (clodinafop)、托比克-炔丙基 (clodinafop-propargyl)、殺雄酸 (clofencet)、可滅蹤 (clomazone)、克普草 (clomeprop)、克普 (cloprop)、必克草 (clopyralid)、氯酯磺草胺 (cloransulam)、氯酯磺草胺-甲基 (cloransulam-methyl)、枯米拉隆 (cumyluron)、氰胺 (cyanamide)、枯那立 (cyanazine)、環丙醯草胺 (cyclanilide)、草滅特 (cycloate)、環磺隆 (cyclosulfamuron)、環殺草 (cycloxydim)、塞拉隆 (cycluron)、賽伏草 (cyhalofop)、賽伏草-丁基 (cyhalofop-butyl)、塞婆闊特 (cyperquat)、塞普拉立 (cyprazine)、塞普拉唑 (cyprazole)、2,4-D、2,4-DB、殺草隆 (daimuron/dymron)、得拉本 (dalapon)、亞拉生長素 (daminozide)、邁隆 (dazomet)、正癸醇、地馬地發 (desmedipham)、敵草淨 (desmetryn)、detosyl-pyrazolate

(DTP)、燕麥敵 (diallate)、麥草畏 (dicamba)、敵草腈 (dichlobenil)、滴丙酸 (dichlorprop)、滴丙酸 -P (dichlorprop-P)、二氯苯氧基氧丙酸酯 (diclofop)、二氯苯氧基氧丙酸甲酯 (diclofop-methyl)、二氯苯氧基氧丙酸 -P-甲酯 (diclofop-P-methyl)、地克羅沙啞 (diclosulam)、地沙替 (diethatyl)、地沙替 -乙基 (diethatyl-ethyl)、地芬諾沙隆 (difenoxuron)、地芬快 (difenzoquat)、地浮拉芬尼市肯 (diflufenican)、地浮拉芬諾比 (diflufenzopyr)、地浮拉芬諾比 -鈉 (diflufenzopyr-sodium)、地美伐隆 (dimefuron)、敵草克鈉 (dikegulac-sodium)、地美伐隆 (dimefuron)、地艾派 (dimepiperate)、地美沙克 (dimethachlor)、地美沙美曲 (dimethametryn)、汰草滅 (dimethenamid)、汰草滅 -P (dimethenamid-P)、穫菱得 (dimethipin)、二甲磺隆 (dimetrasulfuron)、撻乃安 (dinitramine)、達諾殺 (dinoseb)、地諾特 (dinoterb)、大芬滅 (diphenamid)、殺草淨 (dipropetryn)、地快 (diquat)、地快 -二溴 (diquat-dibromide)、汰硫草 (dithiopyr)、達有龍 (diuron)、DNOC、艾格立那立 -乙基 (eglinazine-ethyl)、草多索 (endothal)、EPTC、依斯婆卡 (esprocarb)、依沙氟林 (ethalfluralin)、胺苯磺隆 (ethametsulfuron)、胺苯磺隆 -甲基 (ethametsulfuron-methyl)、益收生長素 (ethephon)、磺隆 (ethidimuron)、乙硫嗪 (ethiozin)、啞草定 (ethofumesate)、乙氧芬 (ethoxyfen)、乙氧芬 -乙基 (ethoxyfen-ethyl)、亞速隆 (ethoxysulfuron)、乙氧苯草胺 (etobenzanid)、F-5331

(即 N-[2-氯-4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-4,5-二氫-5-酮基-1H-四唑-1-基]苯基]乙磺醯胺)、非諾普(fenoprop)、芬殺草(fenoxaprop)、芬殺草-P(fenoxaprop-P)、芬殺草-乙基(fenoxaprop-ethyl)、芬殺草-P-乙基(fenoxaprop-P-ethyl)、四唑草胺(fentrazamide)、非草隆(fenuron)、弗拉普羅(flamprop)、弗拉普羅-P-異丙基(flamprop-M-isopropyl)、弗拉普羅-M-甲基(flamprop-M-methyl)、伏速隆(flazasulfuron)、雙氟磺草胺(florasulam)、伏寄普(fluzifop)、伏寄普-P(fluzifop-P)、伏寄普-丁基(fluzifop-butyl)、伏寄普-P-丁基(fluzifop-P-butyl)、氟佐拉(fluzolate)、氟酮磺隆(flucarbazone)、氟酮磺隆鈉(flucarbazone-sodium)、氟吡磺隆(flucetosulfuron)、氟消草(fluchloralin)、氟草胺(flufenacet)、賽氟滅(thiafluamide)、氟噁草(flufenpyr)、氟噁草-乙基(flufenpyr-ethyl)、氟節胺(flumetralin)、氟滅索命(flumetsulam)、氟米克拉(flumiclorac)、氟米克拉-戊基(flumiclorac-pentyl)、氟米沙立(flumioxazin)、氟米羅必(flumipropyn)、氟滅他隆(flumeturon)、氟地芬(fluorodifen)、氟羅格賴可芬(fluoroglycofen)、氟羅格賴可芬-乙基(fluoroglycofen-ethyl)、弗拉頗沙(flupoxam)、弗拉頗帕斯(flupropacil)、氟丙酸(flupropanate)、氟啞嘧磺隆(flupyr-sulfuron)、氟啞嘧磺隆-甲基-鈉(flupyr-sulfuron-methyl-sodium)、芬醇(flurenol)、芬醇丁酯(flurenol-butyl)、氟立得酮(fluridone)、氟氬得酮

(flurochloridone)、氟氯比(fluroxypyr)、氟氯比-甲基(fluroxypyr-meptyl)、呋嘧醇(flurprimidol)、氟托酮(flurtamone)、氟賽斯特(fluthiacet)、氟賽斯特-甲基(fluthiacet-methyl)、噻啞草醯胺(fluthiamide)、福美沙芬(fomesafen)、甲胺磺隆(foramsulfuron)、福芬素(forchlorfenuron)、福殺胺(fosamine)、福立羅芬(furyloxyfen)、吉貝素(gibberellic acid)、固殺草(glufosinate)、L-固殺草(L-glufosinate)(固殺草-P(glufosinate-P))、L-固殺草-銨(L-glufosinate-ammonium)、固殺草-銨(glufosinate-ammonium)、固殺草-P-鈉(glufosinate-P-sodium)、嘉磷塞(glyphosate)、嘉磷塞-異丙基銨(glyphosate-isopropylammonium)、H-9201、鹵沙芬(halosafen)、鹵殺福隆(halosulfuron)、鹵殺福隆-甲基(halosulfuron-methyl)、合氯氟(haloxypop)、合氯氟-P(haloxypop-P)、合氯氟-乙氧基乙基(haloxypop-ethoxyethyl)、合氯氟-P-乙氧基乙基(haloxypop-P-ethoxyethyl)、合氯氟-甲基(haloxypop-methyl)、合氯氟-P-甲基(haloxypop-P-methyl)、菲殺淨(hexazinone)、HNPC-9908、HOK-201、HW-02、碼扎沙苯(imazamethabenz)、碼扎沙苯-甲基(imazamethabenz-methyl)、嗎紮莫(imazamox)、嗎紮莫-銨(imazamox-ammonium)、依碼比(imazapic)、依滅草(imazapyr)、依滅草-異丙基銨(imazapyr-isopropylammonium)、咪啞啞啞酸(imazaquin)、嗎茲紮比(imazethapyr)、嗎茲紮比-銨(imazethapyr-ammonium)、依

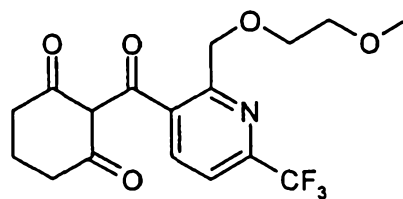
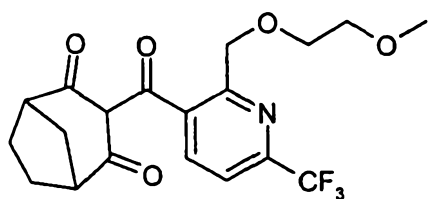
速隆 (imazosulfuron)、抗倒胺 (inabentide)、印得諾非草酮 (indanofan)、吲嗪氟胺 (indaziflam)、吲哚乙酸 (IAA)、4-吲哚-3-基丁酸 (IBA)、碘磺隆 (iodosulfuron)、碘磺隆-甲基-鈉 (iodosulfuron-methyl-sodium)、碘苯腈 (ioxynil)、易卡腓 (ipfencarbazone)、異卡醯胺 (isocarbamid)、異樂靈 (isopropalin)、異丙土隆 (isoproturon)、依索隆 (isouron)、依索苯 (isoxaben)、依索氯托 (isoxachlortole)、依索沙福托 (isoxaflutole)、依索比立福 (isoxapyrifop)、KUH-043、KUH-071、卡靈草 (karbutilate)、酮螺得 (ketospiradox)、累托芬 (lactofen)、環草定 (lenacil)、理有龍 (linuron)、順丁烯二酸肼鹽 (maleic hydrazide)、MCPA、MCPB、MCPB-甲基、-乙基和-鈉)、甲氧丙酸 (mecoprop)、甲氧丙酸鈉 (mecoprop-sodium)、甲氧丙酸丁氧乙酯 (mecoprop-butotyl)、甲氧丙酸-P-丁氧乙酯 (mecoprop-P-butotyl)、甲氧丙酸-P-二甲銨 (mecoprop-P-dimethylammonium)、甲氧丙酸-P-2-乙基己酯 (mecoprop-P-2-ethylhexyl)、甲氧丙酸-P-鉀 (mecoprop-P-potassium)、美芬司特 (mefenacet)、氟草磺 (mefluidide)、甲哌鎊氯 (mepiquat-chloride)、甲磺胺磺隆 (mesosulfuron)、甲磺胺磺隆-甲基 (mesosulfuron-methyl)、美索三酮 (mesotrione)、甲基苯隆 (methabenzthiazuron)、威百畝 (metam)、美他米弗 (metamifop)、苯草酮 (metamitron)、滅草胺 (metazachlor)、滅草定 (methazole)、米噠靈 (methiozolin)、甲氧基酚酮 (methoxyphenone)、甲基代隆 (methyldymron)、1-甲基環丙

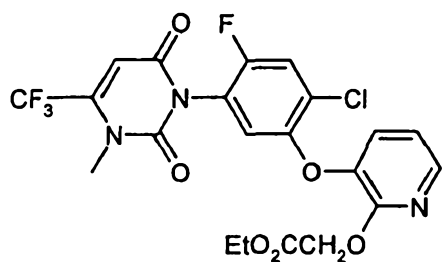
烯、異硫氰酸甲酯、美托苯隆 (metobenzuron)、撲多草 (metobromuron)、莫多草 (metolachlor)、S-莫多草 (S-metolachlor)、美托沙拉 (metosulam)、美托斯隆 (metoxuron)、滅必淨 (metribuzin)、甲磺隆 (metsulfuron)、甲磺隆-甲基 (metsulfuron-methyl)、稻得壯 (molinate)、莫那立得 (monalide)、單尿素 (monocarbamide)、單尿素 (monocarbamide)二硫酸氫鹽、莫若林那隆 (monolinuron)、單噻磺隆 (monosulfuron)、單噻磺隆酯 (monosulfuron ester)、滅草隆 (monuron)、MT 128、MT-5950 (即 N-[3-氯-4-(1-甲基乙基)苯基]-2-甲基戊醯胺)、NGGC-011、那普苯胺 (naproanilide)、那普醯胺 (napropamide)、納得爛 (naptalam)、NC-620、NC-310 (即 4-(2,4-二氯苯甲醯基)-1-甲基-5-苄氧基吡唑)、草不隆 (neburon)、尼磺隆 (nicosulfuron)、尼比拉芬 (nipyraclufen)、磺樂靈 (nitralin)、除草醚 (nitrofen)、硝基苯酚鈉 (異構物混合物)、硝基弗芬 (nitrofluorfen)、壬酸、達草滅 (norflurazon)、奧貝卡 (orbencarb)、鄰磺隆 (orthosulfamuron)、黃草消 (oryzalin)、奧沙地奇 (oxadiargyl)、樂滅草 (oxadiazon)、奧磺隆 (oxasulfuron)、奧沙立克美弗 (oxaziclomefone)、復祿芬 (oxyfluorfen)、帕克丁唑 (paclobutrazole)、巴拉刈 (paraquat)、巴拉刈二鹽酸鹽 (paraquat dichloride)、壬酸、施得圃 (pendimethalin)、噴達靈 (pendralin)、噴諾殺拉 (penoxsulam)、噴立克 (pentanochlor)、噴托唑 (pentoxazone)、氟草磺胺 (perfluidone)、佩索殺米

(pethoxamid) 、 非 尼 索 發 (phenisopham) 、 苯 敵 (phenmedipham) 、 苯 敵 - 乙 基 (phenmedipham-ethyl) 、 毒 莠 定 比 可 林 那 芬 (picloram) 、 比 可 芬 (picolinafen) 、 皮 諾 定 (pinoxaden) 、 派 羅 福 (piperophos) 、 比 立 芬 諾 (pirifenop) 、 比 立 芬 諾 - 丁 基 (pirifenop-butyl) 、 普 拉 草 (pretilachlor) 、 比 米 磺 隆 (primisulfuron) 、 比 米 磺 隆 - 甲 基 (primisulfuron-methyl) 、 普 本 佐 (probenazole) 、 普 氟 佐 (profluazol) 、 普 羅 西 井 (procyazine) 、 普 魯 二 胺 (prodiamine) 、 皮 芬 靈 (prifluraline) 、 普 弗 斯 地 (profoxydim) 、 普 陸 二 酮 (prohexadione) 、 普 陸 二 酮 鈣 (prohexadione-calcium) 、 撲 害 多 (prohydrojasmone) 、 撲 滅 通 (prometon) 、 撲 草 淨 (prometryn) 、 毒 草 安 (propachlor) 、 除 草 靈 (propanil) 、 普 拔 草 (propaquizafop) 、 普 拔 根 (propazine) 、 苯 胺 靈 (propham) 、 普 羅 比 索 克 (propisochlor) 、 丙 氧 卡 巴 脲 (propoxycarbazone) 、 丙 氧 卡 巴 脲 鈉 (propoxycarbazone-sodium) 、 丙 立 磺 隆 (propyrisulfuron) 、 氯 甲 丙 炔 基 苯 甲 醯 胺 (propyzamide) 、 撲 殺 發 林 (prosulfalin) 、 撲 沙 福 卡 (prosulfocarb) 、 普 磺 隆 (prosulfuron) 、 普 立 那 克 羅 (prynachlor) 、 普 克 尼 (pyraclonil) 、 比 拉 福 拉 芬 (pyraflufen) 、 比 拉 福 拉 芬 - 乙 基 (pyraflufen-ethyl) 、 比 磺 托 (pyrasulfotole) 、 比 唑 耐 (pyrazolynate) (pyrazolate) 、 比 唑 磺 隆 (pyrazosulfuron) 、 比 唑 磺 隆 - 乙 基 (pyrazosulfuron-ethyl) 、 比 拉 若 西 芬 (pyrazoxyfen) 、 比 立 本 (pyribambenz) 、 比 立 本 - 異 丙 基 (pyribambenz-isopropyl) 、 比 立 本 - 丙 基

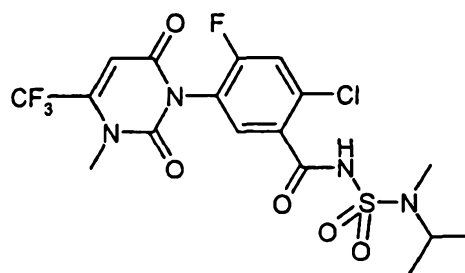
(pyribambenz-propyl)、比立貝若西(pyribenzoxim)、比立丁卡(pyributicarb)、比立達弗(pyridafol)、比達特(pyridate)、比立他立(pyriftalid)、比立米巴克(pyriminobac)、比立米巴克-甲基(pyriminobac-methyl)、比立米芬(pyrimisulfan)、比立塞巴克(pyrithiobac)、比立塞巴克-鈉(pyrithiobac-sodium)、比洛沙風(pyroxasulfone)、比洛沙隆(pyroxsulam)、昆多拉克(quinclorac)、昆美拉克(quinmerac)、昆克胺(quinoclamine)、快伏草(quizalofop)、快伏草-乙基(quizalofop-ethyl)、快伏草-P(quizalofop-P)、快伏草-P-乙基(quizalofop-P-ethyl)、快伏草-P-特呋喃(quizalofop-P-tefuryl)、靈磺隆(rimsulfuron)、沙氟芬(saflufenacil)、塞克布美酮(secbumeton)、西殺草(sethoxydim)、環草隆(siduron)、草滅淨(simazine)、西草淨(simetryn)、SN-106279、硫可三酮(sulcotrione)、草克畏(sulf-allate)(CDEC)、塞芬脞(sulfentrazone)、殺美隆(sulfometuron)、殺美隆-甲基(sulfometuron-methyl)、嘉磷塞三甲(sulfosate)(glyphosate-trimesium)、硫酸磺隆(sulfosulfuron)、SYN-449、SYN-523、SYP-249、SYP-298、SYP-300、替布他(tebutam)、替布隆(tebuthiuron)、替那今(tecnazene)、替呋三酮(tefuryltrione)、替布三酮(tembotrione)、替帕定(tepraloxydim)、特草定(terbacil)、特布卡(terbucarb)、特布克羅(terbuchlor)、甲氧去草淨(terbumeton)、特丁津(terbuthylazine)、去草淨(terbutryne)、TH-547、西尼克羅(thenylchlor)、塞氟醯胺

(thiafluamide)、塞殺福隆(thiazafluron)、塞諾比(thiazopyr)、塞地唑立米(thidiazimin)、塞地唑隆(thidiazuron)、噻吩卡巴腓(thiencarbazone)、噻吩卡巴腓-甲基(thiencarbazone-methyl)、噻吩磺隆(thifensulfuron)、噻吩磺隆-甲基(thifensulfuron-methyl)、塞歐苯卡(thiobencarb)、替歐卡巴力(tiocarbazil)、托米腓(topramezone)、曲考昔地(tralkoxydim)、野麥畏(triallate)、三磺隆(triasulfuron)、曲唑胺(triaziflam)、曲唑諾芬醯胺(triazofenamide)、曲本隆(tribenuron)、曲本隆-甲基(tribenuron-methyl)、三氯乙酸(TCA)、三氯比(triclopyr)、曲地吩(tridiphane)、草達津(trietazine)、三氟氧磺隆(trifloxysulfuron)、三氟氧磺隆鈉(trifloxysulfuron-sodium)、氟樂靈(trifluralin)、三氟磺隆(triflusulfuron)、三氟磺隆-甲基(triflusulfuron-methyl)、曲美他隆(trimeturon)、曲派克(trinexapac)、曲派克-乙基(trinexapac-ethyl)、三多磺隆(tritosulfuron)、替斯托的弗(tsitodef)、優克唑(uniconazole)、優克唑-P(uniconazole-P)、滅草猛(vernolate)、ZJ-0166、ZJ-0270、ZJ-0543、ZJ-0862、及下列化合物：

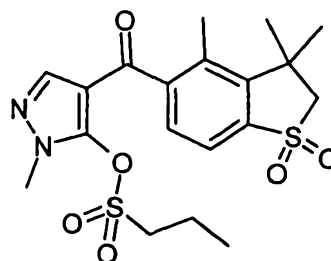
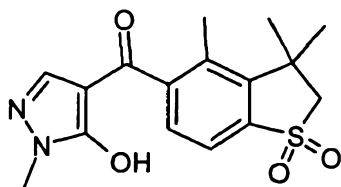




SYN-523

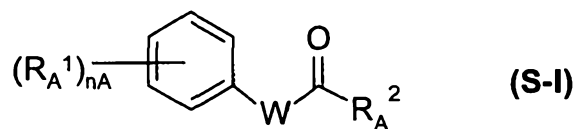


沙氟芬(saflufenacil)



有用植物和觀賞植物之作物中的有害植物之選擇性防治是特別有興趣的。雖然本發明之化合物(I)已顯示對許多作物具有非常好且充份的選擇性之特徵，但是原則上可能對某些作物產生植物毒性，且主要可能發生在與較低選擇性的其他除草劑混合之情況。關於此方面，本發明之化合物(I)之組合物，包含化合物(I)或與其他除草劑或農藥和安全劑之組合物，是特別有興趣的。安全劑(以用作為解毒劑之比率使用)降低所用除草劑/農藥對例如經濟上重要的作物的植物毒性副作用，經濟上重要的作物是例如穀物(小麥、大麥、裸麥、玉米、稻米、高粱/小米)、甜菜、甘蔗、芸苔、棉花和大豆，較佳是穀物。例如，下列群組的化合物適合作為化合物(I)和其與其他農藥的組合物之安全劑：

A) 式(S-I)所示化合物，

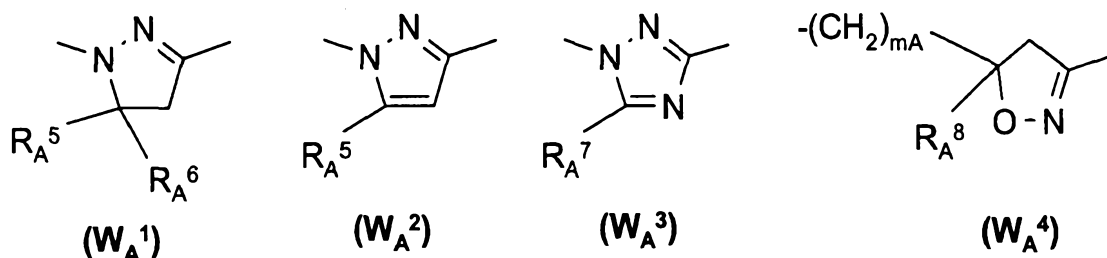


其中符號和標號的定義如下：

$n_A$  是自然數 0 至 5，較佳是 0 至 3；

$R_A^1$  是鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、硝基或 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基；

$W_A$  是未經取代或經取代的二價雜環基團，選自具有 1 至 3 個 N 或 O 的環雜原子且其中至少一個氮原子和至多一個氧原子存在於環中之部份未飽和或芳族五員雜環，較佳是選自 ( $W_A^1$ ) 至 ( $W_A^4$ ) 之基團，



$m_A$  是 0 或 1；

$R_A^2$  是  $OR_A^3$ 、 $SR_A^3$  或  $NR_A^3R_A^4$ ，或是具有至少一個氮原子和至多 3 個雜原子(較佳選自 O 和 S)之飽和或未飽和的 3 至 7 員雜環，且其係經由氮原子連結至於 (S-I) 中的羰基，且其是未經取代或經選自下列的基團所取代：(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基和任意經取代的苯基，較佳是式  $OR_A^3$ 、 $NHR_A^4$  或  $N(CH_3)_2$  所示的基團，特別是式  $OR_A^3$  所示的基團；

$R_A^3$  是氫或未經取代或經取代的脂族烴基，較佳是總共具有 1 至 18 個碳原子；

$R_A^4$  是氫、 $(C_1-C_6)$ -烷基、 $(C_1-C_6)$ -烷氧基或經取代或未經取代的苯基；

$R_A^5$  是 H、 $(C_1-C_8)$ -烷基、 $(C_1-C_8)$ -鹵烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_8)$ -烷基、氰基或  $COOR_A^9$ ，其中  $R_A^9$  是氫、 $(C_1-C_8)$ -烷基、 $(C_1-C_8)$ -鹵烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_1-C_6)$ -羥基烷基、 $(C_3-C_{12})$ -環烷基或三- $(C_1-C_4)$ -烷基甲矽烷基；

$R_A^6$ 、 $R_A^7$ 、 $R_A^8$  相同或不同地為氫、 $(C_1-C_8)$ -烷基、 $(C_1-C_8)$ -鹵烷基、 $(C_3-C_{12})$ -環烷基或經取代或未經取代的苯基；

較佳的是：

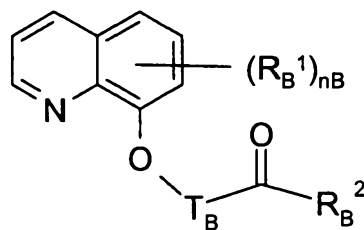
a) 二氯苯基吡啶啉-3-羧酸類化合物，較佳化合物是例如 WO 91/07874 所述之 1-(2,4-二氯苯基)-5-(乙氧基羰基)-5-甲基-2-吡啶啉-3-甲酸乙酯(S1-1)和相關的化合物(“mefenpyr-diethyl”，參見 Pestic. Man.)；

b) 二氯苯基吡啶羧酸衍生物，較佳化合物是例如 EP-A-333 131 和 EP-A-269 806 所揭示之 1-(2,4-二氯苯基)-5-甲基吡啶-3-甲酸乙酯(S1-2)、1-(2,4-二氯苯基)-5-異丙基吡啶-3-甲酸乙酯(S1-3)、1-(2,4-二氯苯基)-5-(1,1-二甲基乙基)吡啶-3-甲酸乙酯(S1-4)、1-(2,4-二氯苯基)-5-苯基吡啶-3-甲酸乙酯(S1-5)，和相關的

化合物：

- c) 三唑羧酸類化合物，較佳化合物是例如 EP-A-174 562 和 EP-A-346 620 所揭示之 fenchlorazole (-乙酯)，即 1-(2,4-二氯苯基)-5-三氟甲基-(1H)-1,2,4-三唑-3-甲酸乙酯(S1-6)，和相關的化合物；
- d) 5-苄基-或 5-苯基-2-異噁唑啉-3-羧酸或 5,5-二苯基-2-異噁唑啉-3-羧酸類化合物，較佳化合物是例如 WO 91/08202 所揭示之 5-(2,4-二氯苄基)-2-異噁唑啉-3-甲酸乙酯(S1-7)或 5-苯基-2-異噁唑啉-3-甲酸乙酯(S1-8)，和相關的化合物，或 WO-A-95/07897 所揭示之 5,5-二苯基-2-異噁唑啉甲酸乙酯(S1-9) (“isoxadifen-ethyl”)、或 5,5-二苯基-2-異噁唑啉甲酸正丙酯(S1-10)、或 5-(4-氟苯基)-5-苯基-2-異噁唑啉-3-甲酸乙酯(S1-11)。

B) 式(S-II)所示之喹啉衍生物，



(S-II)

其中符號和標號的定義如下：

$R_B^1$  是鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、硝基或

(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基；

n<sub>B</sub> 是自然數 0 至 5，較佳是 0 至 3；

R<sub>B</sub><sup>2</sup> 是 OR<sub>B</sub><sup>3</sup>、SR<sub>B</sub><sup>3</sup> 或 NR<sub>B</sub><sup>3</sup>R<sub>B</sub><sup>4</sup>，或是具有至少一個氮原子和至多 3 個雜原子(較佳選自 O 和 S)之飽和或未飽和的 3 至 7 員雜環，且其係經由氮原子連結至於(S-II)中的羰基，且是未經取代或經選自下列的基團所取代：(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基或任意經取代的苯基，較佳是式 OR<sub>B</sub><sup>3</sup>、NHR<sub>B</sub><sup>4</sup> 或 N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub> 所示的基團，特別是式 OR<sub>B</sub><sup>3</sup> 所示的基團；

R<sub>B</sub><sup>3</sup> 是氫或未經取代或經取代的脂族烴基，較佳是總共具有 1 至 18 個碳原子；

R<sub>B</sub><sup>4</sup> 是氫、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基或經取代或未經取代的苯基；

T<sub>B</sub> 是(C<sub>1</sub> 或 C<sub>2</sub>)-烷二基鏈，而其是未經取代或經 1 或 2 個(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基或經[(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)-烷氧基]羰基所取代；

較佳的是：

a) 8-喹啉氧基乙酸(S2)類化合物，較佳是 EP-A-86 750、EP-A-94 349 和 EP-A-191 736 或 EP-A-0 492 366 所揭示之下列化合物：

(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸 1-甲基己酯(常見名稱“cloquintocet-mexyl”(S2-1)，參見 Pestic. Man.)，

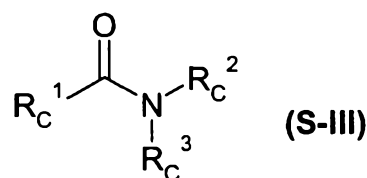
(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸 1,3-二甲基丁-1-酯(S2-2)，

(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸 4-烯丙氧基丁酯(S2-3)，

(5-氯-8-喹啉氧基)乙酸 1-烯丙氧基丙-2-酯(S2-4)，  
 (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸乙酯(S2-5)，  
 (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸甲酯(S2-6)，  
 (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸烯丙酯(S2-7)，  
 (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸 2-(2-亞丙基亞胺氧基)-1-乙酯  
 (S2-8)，  
 (5-氯-8-喹啉氧基)乙酸 2-酮基丙-1-酯(S2-9)和相關的  
 化合物，以及  
 其水合物和鹽，如 WO-A-2002/034048 所揭示。

b) (5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸類化合物，較佳化合物是例  
 如 EP-A-0 582 198 所揭示之(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸  
 二乙酯、(5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸二烯丙酯、  
 (5-氯-8-喹啉氧基)丙二酸甲酯乙酯和相關的化合物。

c) 式(S-III)所示化合物



其中符號和標號的定義如下：

$\text{R}_C^1$  是 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-烯基、  
 (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烯基、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-環烷基，較佳是二氯甲基；  
 $\text{R}_C^2$ 、 $\text{R}_C^3$  相同或不同地為氫、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-  
 烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵

烯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基胺甲醯基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-烯基胺甲醯基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、二噁茂烷基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、噻唑基、呋喃基、呋喃基烷基、噻吩基、哌啶基、經取代或未經取代的苯基，或 R<sub>C</sub><sup>2</sup> 和 R<sub>C</sub><sup>3</sup> 一起形成經取代或未經取代的雜環，較佳是噁唑烷、噻唑烷、哌啶、嗎啉、六氫嘧啶或苯並噁嗪環；

較佳的是：

二氯乙醯胺類活性化合物，經常用作為萌芽前安全劑（作用在土壤的安全劑），例如：

“dichlormid”（參見 Pestic. Man.）（= N,N-二烯丙基-2,2-二氯乙醯胺），

“R-29148”（= 3-二氯乙醯基-2,2,5-三甲基-1,3-噁唑烷，購自 Stauffer），

“R-28725”（= 3-二氯乙醯基-2,2-二甲基-1,3-噁唑烷，購自 Stauffer），

“benoxacor”（參見 Pestic. Man.）（= 4-二氯乙醯基-3,4-二氫-3-甲基-2H-1,4-苯並噁嗪），

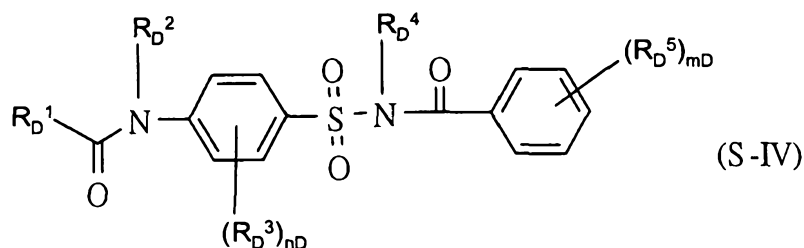
“PPG-1292”（= N-烯丙基-N-[(1,3-二噁茂烷-2-基)甲基]二氯乙醯胺，購自 PPG Industries），

“DKA-24”（= N-烯丙基-N-[(烯丙基胺羰基)甲基]二氯乙醯胺，購自 Sagro-Chem），

“AD-67”或“MON 4660”（= 3-二氯乙醯基-1-氧雜-3-氮

雜螺[4,5]癸烷，購自 Nitrokemia 或 Monsanto)，  
 “TI-35” (= 1-二氯乙醯基氮雜環庚烷，購自 TRI-  
 Chemical RT)  
 “diclonon” (dicyclonone) 或 “BAS145138” 或  
 “LAB145138” (= 3-二氯乙醯基-2,5,5-三甲基-1,3-二  
 氮雜二環[4.3.0]壬烷，購自 BASF)，及  
 “furilazole”或“MON 13900” (參見 Pestic. Man.) (=   
 (RS)-3-二氯乙醯基-5-(2-呋喃基)-2,2-二甲基噁唑烷)  
 。

D) 式(S-IV)所示 N-醯基磺醯胺及其鹽，



其中

$R_D^1$  是氫、烴基、烴氧基、烴硫基或雜環基，其較佳是經由碳原子連結，其中該 4 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個相同或不同之選自下列的基團所取代：  
 鹵素、氰基、硝基、胺基、烴基、羧基、甲醯基、醯胺、磺醯胺、和式  $-Z^a-R^a$  所示基團，  
 其中各個烴基較佳具有 1 至 20 個碳原子，及含碳基團  $R_D^1$  較佳具有(含取代基) 1 至 30 個碳原子；

$R_D^2$  是氫或  $(C_1-C_4)$ -烷基，較佳是氫，或

$R_D^1$  和  $R_D^2$  與式  $-CO-N-$  所示基團一起為具有一個 3-至 8-員飽和或未飽和環之基團；

$R_D^3$  相同或不同地為鹵素、氰基、硝基、胺基、羥基、羧基、甲醯基、 $CONH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、或式  $-Z^b-R^b$  所示的基團；

$R_D^4$  是氫或  $(C_1-C_4)$ -烷基，較佳是 H；

$R_D^5$  相同或不同地為鹵素、氰基、硝基、胺基、羥基、羧基、 $CHO$ 、 $CONH_2$ 、 $SO_2NH_2$ 、或式  $-Z^c-R^c$  所示的基團；

$R^a$  是羥基或雜環基，其中該 2 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個相同或不同之選自下列的基團所取代：鹵素、氰基、硝基、胺基、羥基、單-和二- $[(C_1-C_4)$ -烷基]胺基、或烷基(其中複數個(較佳是 2 或 3 個)不相鄰的  $CH_2$  基團各自經氧原子所置換)；

$R^b$ ， $R^c$  相同或不同地為羥基或雜環基，其中該 2 個最後提及的基團是未經取代或經一或多個相同或不同之選自下列的基團所取代：鹵素、氰基、硝基、胺基、羥基、磷酸基、鹵- $(C_1-C_4)$ -烷氧基、單-和二- $[(C_1-C_4)$ -烷基]胺基、或烷基(其中複數個(較佳是 2 或 3 個)不相鄰的  $CH_2$  基團各自經氧原子所置換)；

$Z^a$  是式  $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-CO-$ 、 $-CS-$ 、 $-CO-O-$ 、 $-CO-S-$ 、 $-O-CO-$ 、 $-S-CO-$ 、 $-SO-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-NR^*-$ 、 $-CO-NR^*-$ 、 $-NR^*-CO-$ 、 $-SO_2-NR^*-$  或  $-NR^*-SO_2-$  所示之二價基團，

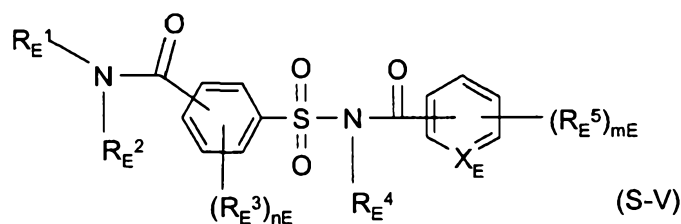
其中各個二價基團之右邊的鍵是連結至基團  $R^a$  的鍵，其中該 5 個最後提及的基團中之  $R^*$  於各個情況中彼此各自獨立地為 H、 $(C_1-C_4)$ -烷基或鹵- $(C_1-C_4)$ -烷基；

$Z^b, Z^c$  彼此各自獨立地為一鍵或式 -O-、-S-、-CO-、-CS-、-CO-O-、-CO-S-、-O-CO-、-S-CO-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-NR\*-、-SO<sub>2</sub>-NR\*-、-NR\*-SO<sub>2</sub>-、-CO-NR\*-或 -NR\*-CO-所示之二價基團，其中各個二價基團之右邊的鍵是連結至基團  $R^b$  或  $R^c$  的鍵，其中該 5 個最後提及的基團之  $R^*$  於各個情況中彼此各自獨立地為 H、 $(C_1-C_4)$ -烷基或鹵- $(C_1-C_4)$ -烷基；

$n_D$  是整數 0 至 4，較佳是 0、1 或 2，特別是 0 或 1，及

$m_D$  是整數 0 至 5，較佳是 0、1、2 或 3，特別是 0、1 或 2。

E) 通式 (S-V) 所示之醯基胺磺醯基苯甲醯胺，適當的話亦為鹽形式，



其中

$X_E$  是 CH 或 N；

$R_E^1$  是氫、雜環基或烴基，其中該 2 個最後提及的基團是

任意經一或多個相同或不同之選自鹵素、氰基、硝基、胺基、羥基、羧基、CHO、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> 和 Z<sup>a</sup>-R<sup>a</sup> 的基團所取代；

R<sub>E</sub><sup>2</sup> 是氫、羥基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基，其中該 5 個最後提及的基團是任意經一或多個相同或不同之選自鹵素、羥基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基和 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基的基團所取代，或

R<sub>E</sub><sup>1</sup> 和 R<sub>E</sub><sup>2</sup> 與攜帶此二基團的氮原子一起為是 3 至 8 員飽和或未飽和環；

R<sub>E</sub><sup>3</sup> 是鹵素、氰基、硝基、胺基、羥基、羧基、CHO、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> 或 Z<sup>b</sup>-R<sup>b</sup>；

R<sub>E</sub><sup>4</sup> 是氫、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-烯基或 (C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-炔基；

R<sub>E</sub><sup>5</sup> 是鹵素、氰基、硝基、胺基、羥基、羧基、磷酸基、CHO、CONH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub> 或 Z<sup>c</sup>-R<sup>c</sup>；

R<sup>a</sup> 是 (C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>)-烷基 (而其碳鏈是經氧原子中斷一或多次)、雜環基或烴基，其中該 2 個最後提及的基團是任意經一或多個相同或不同之選自鹵素、氰基、硝基、胺基、羥基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺基的基團所取代；

R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup> 相同或不同地為 (C<sub>2</sub>-C<sub>20</sub>)-烷基 (而其碳鏈是經氧原子中斷一或多次)、雜環基或烴基，其中該 2 個最後提及的基團是任意經一或多個相同或不同之選自鹵素、氰基、硝基、胺基、羥基、磷酸基、

(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺基的基團所取代；

Z<sup>a</sup> 是選自 O、S、CO、CS、C(O)O、C(O)S、SO、SO<sub>2</sub>、NR<sup>d</sup>、C(O)NR<sup>d</sup> 和 SO<sub>2</sub>NR<sup>d</sup> 之二價基團；

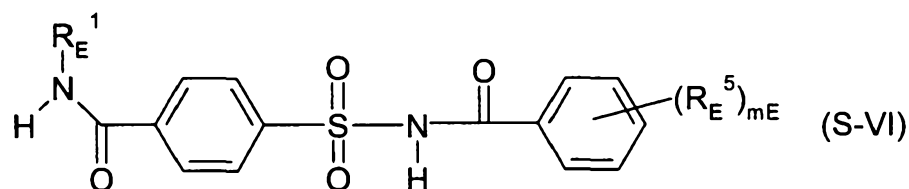
Z<sup>b</sup>、Z<sup>c</sup> 相同或不同地為一鍵或選自 O、S、CO、CS、C(O)O、C(O)S、SO、SO<sub>2</sub>、NR<sup>d</sup>、SO<sub>2</sub>NR<sup>d</sup> 和 C(O)NR<sup>d</sup> 之二價基團；

R<sup>d</sup> 是氫、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基；

n<sub>E</sub> 是整數 0 至 4，及

m<sub>E</sub> 當 X 是 CH 時，m<sub>E</sub> 是整數 0 至 5，而當 X 是 N 時，m<sub>E</sub> 是整數 0 至 4；

其中，較佳的是例如下式 (S-VI) 所示之醯基胺磺醯基苯甲醯胺類化合物 (亦包括其鹽形式)，其係已知，例如，揭示於 WO 99/16744，



例如下列化合物：

R<sub>E</sub><sup>1</sup> = 環丙基，和 R<sub>E</sub><sup>5</sup> = 2-OMe (“cyprosulfamide”、S3-1)，

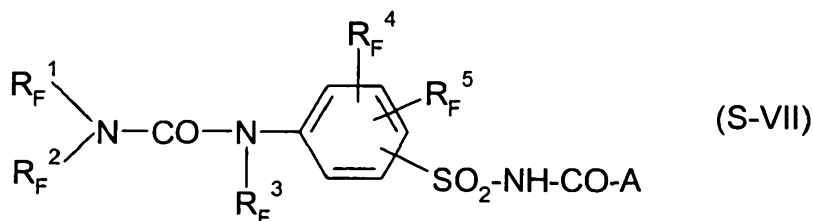
R<sub>E</sub><sup>1</sup> = 環丙基，和 R<sub>E</sub><sup>5</sup> = 5-Cl-2-OMe (S3-2)，

R<sub>E</sub><sup>1</sup> = 乙基，和 R<sub>E</sub><sup>5</sup> = 2-OMe (S3-3)，

$R_E^1 =$  異丙基，和  $R_E^5 = 5\text{-Cl-2-OMe}$  (S3-4)，及

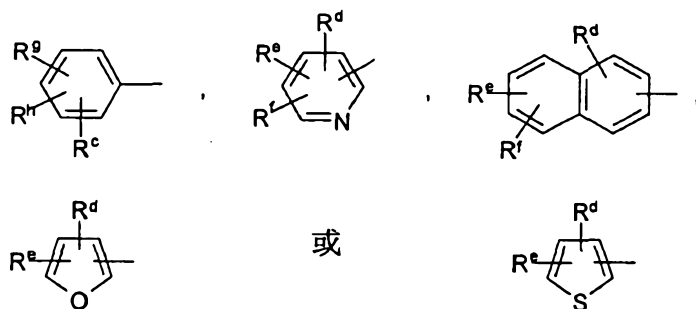
$R_E^1 =$  異丙基，和  $R_E^5 = 2\text{-OMe}$  (S3-5)。

F) 式 (S-VII) 所示之 N-醯基胺磺醯基苯基脲類化合物，其為已知，例如根據 EP-A-365484 所述，



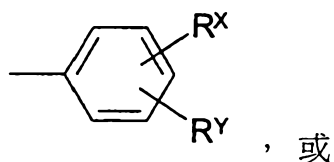
其中

A 是選自下列之基團：



$R_F^1$  和  $R_F^2$  彼此各自獨立地為氫、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-環烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基，

經 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基取代的 或 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基



$R_F^1$  和  $R_F^2$  一起為 (C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>)-伸烷基橋或經氧、硫、SO、SO<sub>2</sub>、NH 或 -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基)-所中斷的 (C<sub>4</sub>-C<sub>6</sub>)-伸烷基橋，

$R_F^3$  是氫或 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基，

$R_F^4$  和  $R_F^5$  彼此各自獨立地為氫、鹵素、氰基、硝基、三氟甲基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷亞磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷磺醯基、-COOR<sup>j</sup>、-CONR<sup>k</sup>R<sup>m</sup>、-COR<sup>n</sup>、-SO<sub>2</sub>NR<sup>k</sup>R<sup>m</sup> 或 -OSO<sub>2</sub>-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，或 R<sup>a</sup> 和 R<sup>b</sup> 一起為可經鹵素或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基所取代的 (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-伸烷基橋、或可經鹵素或 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基所取代的 (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-伸烯基橋、或可經鹵素或 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基所取代的 C<sub>4</sub>-伸烷二烯基橋，及

$R^g$  和  $R^h$  彼此各自獨立地為氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、三氟甲基、甲氧基、甲硫基或 -COOR<sup>j</sup>，其中

$R^c$  是氫、鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基或甲氧基，

$R^d$  是氫、鹵素、硝基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷亞磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷磺醯基、-COOR<sup>j</sup> 或 -CONR<sup>k</sup>R<sup>m</sup>，

$R^e$  是氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、-COOR<sup>j</sup>、三氟甲基或甲氧基，或  $R^d$  和  $R^e$  一起為 (C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>)-伸烷基橋，

$R^f$  是氫、鹵素或 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基，

$R^x$  和  $R^y$  彼此各自獨立地為氫、鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基、-COOR<sup>4</sup>、三氟甲基、硝基或氰基，

$R^j$ 、 $R^k$  和  $R^m$  彼此各自獨立地為氫或  $(C_1-C_4)$ -烷基，  
 $R^k$  和  $R^m$  一起為  $(C_4-C_6)$ -伸烷基橋或經氧、NH 或 -  
 $N(C_1-C_4)$ -所中斷的  $C_4-C_6$ -伸烷基橋，及  
 $R^n$  是  $(C_1-C_4)$ -烷基、苯基、或經鹵素、 $(C_1-C_4)$ -烷基、甲  
 氧基、硝基或三氟甲基取代的苯基，

其中較佳的是：

1-[4-(N-2-甲氧基苯甲醯基胺磺醯基)苯基]-3-甲基脲，

1-[4-(N-2-甲氧基苯甲醯基胺磺醯基)苯基]-3,3-二甲基脲，

1-[4-(N-4,5-二甲基苯甲醯基胺磺醯基)苯基]-3-甲基脲，

1-[4-(N-萘醯基胺磺醯基)苯基]-3,3-二甲基脲，

包含其立體異構物、及農業上慣用的鹽類。

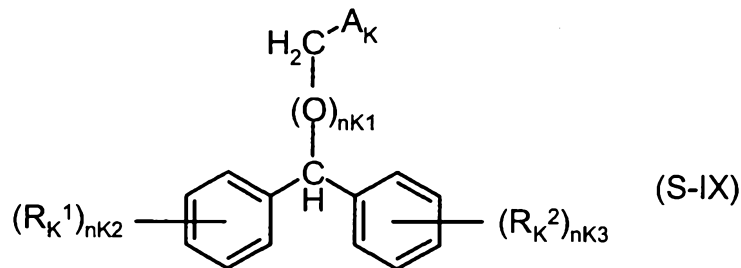
G) 羥基芳族類和芳族-脂族羧酸衍生物類之活性化合物，例如 3,4,5-三乙醯氧基苯甲酸乙酯、3,5-二甲氧基-4-羥基苯甲酸、3,5-二羥基苯甲酸、4-羥基水楊酸、4-氟水楊酸、1,2-二氫-2-酮基-6-三氟甲基吡啶-3-甲醯胺、2-羥基肉桂酸、2,4-二氫肉桂酸，根據 WO 2004084631、WO 2005015994、WO 2006007981、WO 2005016001 所述。

H) 1,2-二氫喹噁啉-2-酮類之活性化合物，例如 1-甲基-3-(2-噁吩基)-1,2-二氫喹噁啉-2-酮、1-甲基-3-(2-噁吩基)-1,2-二氫喹噁啉-2-硫酮、1-(2-胺基乙基)-3-(2-噁吩基)-1,2-二氫喹噁啉-2-酮鹽酸鹽、1-(2-甲基磺醯基胺基乙基)-3-(2-噁吩基)-1,2-二氫喹噁啉-2-酮，根據 WO 2005112630 所述。

I) 除了對有害植物具有除草作用以外，亦對作物(例如米)具有安全劑的作用之活性化合物，例如：  
“地艾派(dimepiperate)”或“MY-93”(參見 Pestic. Man.) (=S-1-甲基-1-苯基乙基哌啶-1-硫甲酸酯)，已知是為對抗除草劑稻得壯(molinate)對米的傷害之安全劑，  
“殺草隆(daimuron)”或“SK 23”(參見 Pestic. Man.) (=1-(1-甲基-1-苯基乙基)-3-對-甲苯基脲)，已知是為對抗除草劑依速隆(imazosulfuron)對米的傷害之安全劑，  
“枯米拉隆(cumyluron)” = “JC-940” (= 3-(2-氯苯基甲基)-1-(1-甲基-1-苯基-乙基)脲，參見 JP-A-60087254)  
，已知是為對抗多種除草劑對米的傷害之安全劑，  
“甲氧基酚酮(methoxyphenone)”或“NK 049”(= 3,3'-二甲基-4-甲氧基苯醯苯)，已知是為對抗多種除草劑對米的傷害之安全劑，  
“CSB”(= 1-溴-4-(氯甲基磺醯基)苯)(CAS 註冊號

54091-06-4，來自 Kumiai)，已知是為對抗多種除草劑對米的傷害之安全劑。

K) 根據 WO-A-1998/38856 所述之式 (S-IX) 所示化合物：



其中符號和標號的定義如下：

$R_K^1$ 、 $R_K^2$  彼此各自獨立地為鹵素、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷基胺基、二- $(C_1-C_4)$ -烷基胺基、硝基；

$A_K$  是  $COOR_K^3$  或  $COOR_K^4$ ，

$R_K^3$ 、 $R_K^4$  彼此各自獨立地為氫、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_2-C_6)$ -烯基、 $(C_2-C_4)$ -炔基、氰基烷基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基、苯基、硝基苯基、苄基、鹵苄基、吡啶基烷基或烷基銨，

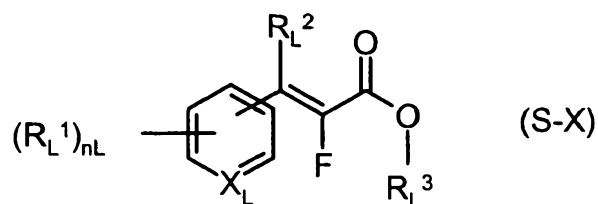
$n_K^1$  是 0 或 1，

$n_K^2$ 、 $n_K^3$  彼此各自獨立地為 0、1 或 2，

較佳的是：

(二苯基甲氧基)乙酸甲酯 (CAS 註冊號：41858-19-9)，

L) 根據 WO A-98/27049 所述之式 (S-X) 所示化合物，



其中符號和標號的定義如下：

$X_L$  是 CH 或 N，

$n_L$  當  $X = N$  時， $n_L$  為整數 0 至 4，且當  $X = CH$  時， $n_L$  為整數 0 至 5，

$R_L^1$  是鹵素、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基、硝基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基、 $(C_1-C_4)$ -烷磺醯基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧羰基、任意經取代的苯基、任意經取代的苯氧基，

$R_L^2$  是氫或  $(C_1-C_4)$ -烷基，

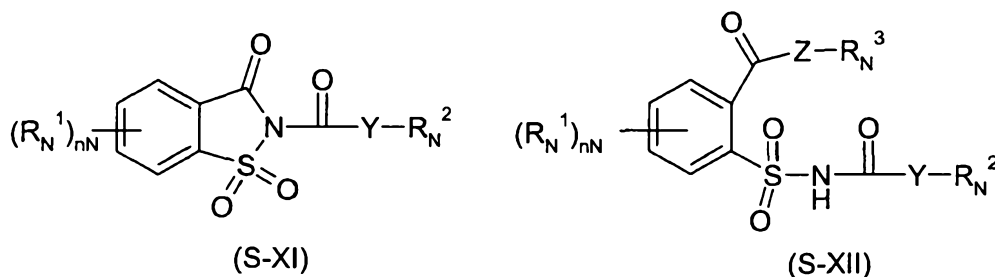
$R_L^3$  是氫、 $(C_1-C_8)$ -烷基、 $(C_2-C_4)$ -烯基、 $(C_2-C_4)$ -炔基或芳基，其中上述之含碳基團分別是未經取代或經一或多個，較佳是至多 3 個，相同或不同之選自鹵素和烷氧基的基團所取代；或其鹽。

M) 3-(5-四唑基羰基)-2-喹啉酮類活性化合物，根據 WO-A-1999000020 所述，例如：

1,2-二氫-4-羥基-1-乙基-3-(5-四唑基羰基)-2-喹啉酮  
(CAS 註冊號：219479-18-2)、1,2-二氫-4-羥基-1-甲  
基-3-(5-四唑基羰基)-2-喹啉酮 (CAS 註冊號：95855-

00-8)。

N) 根據 WO-A-2007023719 和 WO-A-2007023764 所述之式 (S-XI) 或 (S-XII) 所示化合物



其中

$R_N^1$  是鹵素、 $(C_1-C_4)$ -烷基、甲氧基、硝基、氰基、 $CF_3$ 、 $OCF_3$ ，

Y、Z 彼此各自獨立地為 O 或 S，

$n_N$  是整數 0 至 4，

$R_N^2$  是  $(C_1-C_{16})$ -烷基、 $(C_2-C_6)$ -烯基、 $(C_3-C_6)$ -環烷基、芳基、苄基、鹵苄基，

$R_N^3$  是氫、 $(C_1-C_6)$  烷基；

O) 一或多個選自下列的化合物：

1,8-萘酸酐，

S-2-乙硫基乙基磷二硫酸 O,O-二乙酯 (disulfoton)，

甲基胺基甲酸 4-氯苯酯 (mephenate)，

磷二硫酸 O,O-二乙酯 O-苯酯 (dietholate)，

4-羧基-3,4-二氫-2H-1-苯並吡喃-4-乙酸 (CL-304415)，

CAS 註冊號：31541-57-8)，

1-氧雜-4-氮雜螺[4.5]癸烷-4-甲二硫酸 2-丙烯酸酯 (MG-838，CAS 註冊號：133993-74-5)，

[(3-酮基-1H-2-苯並硫喃-4(3H)-亞基)甲氧基]乙酸甲酯 (根據 WO-A-98/13361；CAS 註冊號：205121-04-6)

，  
氰基甲氧基亞胺基(苯基)乙腈 (cyometrinil)，

1,3-二噁茂烷-2-基甲氧基亞胺基(苯基)乙腈 (oxabetrinil)，

4'-氯-2,2,2-三氟乙醯苯 O-1,3-二噁茂烷-2-基甲基肟 (fluxofenim)，

4,6-二氯-2-苯基嘧啶 (fencloirim)，

2-氯-4-三氟甲基-1,3-噻唑-5-甲酸苄酯 (flurazole)，

2-二氯甲基-2-甲基-1,3-二噁茂烷 (MG-191)，

包含其立體異構物、及農業上慣用的鹽類。

除草劑(混合物)對安全劑的重量比通常決定於除草劑的應用比率以及所考慮的安全劑之效用，且可在廣泛的範圍內變化，例如 200：1 至 1：200 的範圍內，較佳是 100：1 至 1：100 的範圍內，特別是 20：1 至 1：20 的範圍內。安全劑可依類似方法調配至化合物(I)或其與其他除草劑/農藥的混合物中，且可以與除草劑形成之最終調合物或槽混合物的形態提供和使用。

當使用時，除草劑或除草劑/安全劑調合物以由市面

購得的形態，適當的話，依慣用的方法稀釋，例如在可潤濕性粉末、可乳化的濃縮液、分散液和水可散的粒劑的情況使用水加以稀釋。粉劑、供土壤應用或播灑用的粒劑、和可噴灑的溶液形態之製劑通常在使用前不再以其他惰性物質加以稀釋。

式(I)所示化合物和/或其鹽所需的應用比率特別是根據外在條件例如溫度、濕度和所用除草劑的種類而變化。其可在廣泛範圍內變化。當應用除草劑以防治有害植物時，其是，例如，在 0.001 至 10.0 kg/ha 或更高的活性物質之範圍內，較佳是在 0.005 至 5 kg/ha 的活性物質之範圍內，特別是在 0.01 至 1 kg/ha 的活性物質之範圍內。此量同時適用於萌芽前和萌芽後的應用。

當用作為植物生長調節劑時，例如作為類似於上述的作物之稈安定劑，較佳是穀類植物，例如小麥、大麥、裸麥、黑小麥、小米、稻米或玉米，例如，在 0.001 至 2 kg/ha 或更高的活性物質之範圍內，較佳是 0.005 至 1 kg/ha 的活性物質之範圍內，特別是 10 至 500 g/ha 的活性物質之範圍內，非常特別是 20 至 250 g/ha 的活性物質之範圍內。此範圍均適合於以萌芽前方法和萌芽後方法之應用，萌芽後處理通常是較佳的。

作為稈安定劑的應用可在植物生長的各個階段進行。例如，較佳的是應用在分蘖期之後，縱向生長剛開始時。

或者，亦可能藉由處理種子而用作為植物生長調節劑，此涵蓋各種包含拌種和塗覆種子的技術。在此，應用比

率決定於特定的技術且可由初步試驗而加以判定。

以例舉的方式，將通式(I)化合物的一些合成範例描述於下文。

### 【實施方式】

實例中，除非特別指明，含量(包含百分比)係指以重量計。在說明和實例中，當式(I)立體異構物的對掌中心之絕對構型有指定“R”和“S”時，則此 RS 命名係根據 Cahn-Ingold-Prelog 原則，除非有不同的定義。

#### (A) 合成例

實例 A1 5-(4-氯苯基)-3-甲基-1-(嘓啶-5-基)-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯(參見表 2，實例 2-28)

a) [5-(4-氯苯基)-3-甲基-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯的製備

2.236 g (45 mmol)水合肼加至由 10 g (37 mmol) 3-[(4-氯苯基)羰基]-4-酮基戊酸甲酯於乙醇(100 ml)所形成的溶液中。混合物在回流的情況下加熱 6 小時，接著加至水中並以二氯甲烷萃取。合併的有機層經硫酸鎂乾燥、過濾和濃縮。得 6.9 g 產物(63%理論值)。

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 2.28 (s, 3H); 3.5 (s, 2H); 3.7 (s, 3H); 7.39 (d, 2H); 7.5 (d, 2H)。

b) [5-(4-氯苯基)-3-甲基-1-(嘓啶-5-基)-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯的製備

0.287 g (2 mmol) 氟化鈹、0.103 g (1 mmol) 乙酸銅(II) 和 0.212 g (2 mmol) 第三丁醇鉀加至於 10 ml 二氯甲烷中的 0.5 g (2 mmol) [5-(4-氯苯基)-3-甲基-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯內。接著加入 0.234 g (2 mmol) 5-嘓啶基硼酸，混合物在 20°C 下攪拌 45 小時。混合物接著加至飽和氯化銨溶液(10 ml)中並以二氯甲烷萃取。合併的有機層經硫酸鎂乾燥、過濾和濃縮。粗產物經製備型 HPLC 純化。得 0.040 g 產物(5.8%理論值)。

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 2.36 (s, 3H); 3.4 (s, 2H); 3.71 (s, 3H); 7.2 (d, 2H); 7.41 (d, 2H); 8.53 (s, 2H); 9.05 (s, 1H)。

實例 A2 [5-(4-氯苯基)-1-(2-氯嘓啶-5-基)-3-甲基-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯(參見表 2, 實例 2-29)

0.515 g (3 mmol) 乙酸銅(II)和 0.306 ml (4 mmol) 吡啶加至由 0.5 g (2 mmol) [5-(4-氯苯基)-3-甲基-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯於 10 ml 二氯甲烷所形成的溶液中。接著加入 0.598 g (4 mmol) 2-氯嘓啶-5-硼酸，混合物在 20°C 下攪拌 24 小時。接著混合物加至 1 M HCl 中，並以二氯甲烷萃取。合併的有機層經硫酸鎂乾燥、過濾和濃縮。以製備型 HPLC 純化粗產物。得 0.015 g 產物(2%理論值)。

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 2.34 (s, 3H); 3.39 (s,

2H); 3.71 (s, 3H); 7.2 (d, 2H); 7.45 (d, 2H); 8.52 (s, 2H)。

實例 A3 [3-甲基-5-苯基-1-(吡嗪-2-基)-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯(參見表 11, 實例 11-2)

0.378 g (3.330 mmol) 3-胼基吡嗪於 12.5 ml 乙醇中, 加至 0.600 g (2.561 mmol) 4-酮基-3-(苯羰基)戊酸甲酯中, 混合物於密封容器內於微波爐中在 135°C 下加熱 1.5 小時。在低壓下除去溶劑, 殘餘物置於二氯甲烷中, 並以水沖洗二次, 每次 25 ml。合併的有機層於硫酸鈉上乾燥, 並在低壓下除去溶劑。使殘餘物進行層析, 得 0.115 g (13.8%理論值)淡黃色蠟狀物。

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz): 2.39 (s, 3H); 3.40 (s, 2H); 3.69 (s, 3H); 7.23 (m, 2H); 7.39 (m, 3H); 8.22 (dd, 1H); 8.38 (dd, 1H); 8.66 (d, 1H)。

實例 A4 [3-甲基-5-苯基-1-(吡嗪-2-基)-1H-吡啶-4-基]乙酸(參見表 10, 實例 10-2)

0.073 g (1.819 mmol) 2-莫耳濃度氫氧化鈉水溶液加至溶於 5 ml 甲醇之 0.165 g (0.455 mmol) [3-甲基-5-苯基-1-(吡嗪-2-基)-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯(參見 A3)中, 混合物在 20°C 下攪拌 1 小時。在低壓下除去甲醇, 將殘餘物倒入 10 ml 水和 15 ml 二氯甲烷的混合物中。水層經 15 ml 二氯甲烷萃取, 以濃鹽酸(pH = 3)酸化, 及以二氯甲烷萃

取三次，每次 15 ml。乾燥合併的有機層及在低壓下除去溶劑，得 0.080 g (59.7%理論值)無色泡沫狀固體，熔點 125°C。

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz): 2.4 (s, 3H); 3.42 (s, 2H); 7.25 (m, 2H); 7.39 (m, 3H); 8.22 (dd, 1H); 8.39 (dd, 1H); 8.70 (d, 1H); 8.97 (br s, 1H)。

實例 A5 [1-(6-氯噻嗪-3-基)-3-甲基-5-苯基-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯(參見表 5, 實例 5-7)

a) [1-(6-氯噻嗪-3-基)-5-羥基-3-甲基-5-苯基-4,5-二氫-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯的製備

0.296 g (2.049 mmol) 3-氯-6-肼基噻嗪於 5.00 ml 乙醇中，加至 0.400 g (1.708 mmol) 4-酮基-3-(苯羰基)戊酸甲酯中，混合物在回流的情況下攪拌 8 小時。在低壓下除去溶劑，使殘餘物進行層析後，得 0.300 g (48%理論值)黏質黃色油狀物。

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz): 1.94 (s, 3H); 2.81 (dd, 1H); 3.12 (dd, 1H); 3.67 (s, 3H); 4.91 (dd, 1H); 7.34 (d, 1H); 7.41 (d, 1H); 7.45 (m, 2H); 7.59 (m, 1H); 8.01 (d, 1H); 8.03 (d, 1H)。

b) [1-(6-氯噻嗪-3-基)-3-甲基-5-苯基-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯的製備

0.111 g (2.772 mmol) 2-莫耳濃度氫氧化鈉水溶液加至溶於 8 ml 甲醇中之 0.200 g (0.554 mmol) [1-(6-氯噻嗪-3-基)-5-羥基-3-甲基-5-苯基-4,5-二氫-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯，混合物在 20°C 下攪拌 1 小時。在低壓下除去甲醇，將殘餘物倒入 10 ml 水和 15 ml 二氯甲烷的混合物中。水層經 15 ml 二氯甲烷萃取，以濃鹽酸 (pH = 3) 酸化，及以二氯甲烷萃取三次，每次 15 ml。乾燥合併的有機層及在低壓下除去溶劑，得 0.207 g (99% 理論值) 棕色蠟狀固體，熔點 55°C。

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz): 2.39 (s, 3H); 3.42 (s, 2H); 4.3 (s, 3H); 6.9 (d, 1H); 7.28 (m, 2H); 7.37 (m, 3H); 7.63 (d, 1H)。

實例 A6 [1-(6-氯噻嗪-3-基)-3-甲基-5-苯基-1H-吡啶-4-基]乙酸 (參見表 4, 實例 4-7)

0.058 g (1.444 mmol) 2-莫耳濃度氫氧化鈉水溶液加至於 5.00 ml 甲醇中之 0.099 g (0.289 mmol) [1-(6-氯噻嗪-3-基)-3-甲基-5-苯基-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯，混合物在 20°C 下攪拌 1 小時。在低壓下除去甲醇，將殘餘物倒入 10 ml 水和 15 ml 二氯甲烷的混合物中。水層經 15 ml 二氯甲烷萃取，以濃鹽酸 (pH = 3) 酸化，及以二氯甲烷萃取三次，每次 15 ml。乾燥合併的有機層及在低壓下除去溶劑，得 0.052 g (54.7% 理論值) 棕色蠟狀固體。

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz): 2.36 (s, 3H); 3.40 (s,

2H); 7.28 (m, 2H); 7.37 (m, 3H); 7.51 (d, 1H); 7.87 (br d, 1H)。

實例 A7 3-[(4-氯苯基)羰基]-4-酮基戊酸甲酯(參見表 13, 實例 13-13)

10 g (51 mmol) 1-(4-氯苯基)丁烷-1,3-二酮(由市面購得)溶於二甲亞砷所形成的溶液緩緩地逐滴加至由 2.237 g (56 mmol)氫化鈉於 200 ml 二甲亞砷所形成的溶液中, 使得溫度不超過 30°C。混合物在 20°C 下再攪拌 30 分鐘。接著在 0°C 下緩緩逐滴添加於少量二甲亞砷中之 8.558 g (56 mmol)溴乙酸甲酯。混合物在 20°C 下攪拌 4 小時。將反應混合物倒入冰-水中, 並以二氯甲烷萃取。以水反覆沖洗有機層。乾燥合併的有機層及在低壓下除去溶劑, 使殘餘物進行層析後, 得 7.750 g 產物(56.7%理論值)。

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 2.19 (s, 3H); 2.99 (d, 1H); 3.03 (d, 1H); 3.69 (s, 3H); 4.95 (dd, 1H); 7.49 (d, 2H); 7.98 (d, 2H)。

實例 A8 4-酮基-3-(吡啶-2-基羰基)戊酸甲酯(參見表 13, 實例 13-68)

a) 1-(吡啶-2-基)丁烷-1,3-二酮的製備

甲醇鈉溶液(28%於甲醇中)逐滴加至 10 g (73 mmol)吡啶甲酸甲酯和 25 ml (124 mmol)丙酮於 150 ml 四氫呋喃的

混合物中。混合物在 20℃ 下攪拌 3 小時，及在低壓下除去溶劑。殘餘物置於水中，以 2-莫耳濃度鹽酸水溶液酸化，及以二氯甲烷萃取。乾燥合併的有機層，及在低壓下除去溶劑，得 7.940 g 產物 (60%理論值)。

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 2.23 (s, 3H); 6.81 (s, 1H); 7.41 (m, 1H); 7.83 (m, 1H); 8.09 (m, 1H); 8.68 (m, 1H); 15.7 (br, 1H)。

b)

將 3.38 g (20.7 mmol) 1-(吡啶-2-基)丁烷-1,3-二酮溶於二甲亞砷所形成的溶液緩緩逐滴加至於 25 ml 二甲亞砷中的 0.911 g (22.78 mmol) 氫化鈉內，使溫度不超過 30℃。混合物在 20℃ 下再攪拌 30 分鐘。接著在 0℃ 下緩緩逐滴加入於少量二甲亞砷中的 3.486 g (22.78 mmol) 溴乙酸甲酯。混合物在 20℃ 下繼續攪拌 4 小時。將反應混合物倒入冰-水中並以二氯甲烷萃取。反覆以水沖洗有機層。乾燥合併的有機層，在低壓下除去溶劑，使殘餘物進行層析，得 3.48 g 產物 (71.4%理論值)。

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 2.4 (s, 3H); 2.9 (d, 1H); 3.05 (d, 1H); 3.69 (s, 3H); 5.49 (dd, 1H); 7.50 (m, 1H); 7.86 (m, 1H); 8.07 (m, 1H); 8.7 (m, 1H)。

實例 A9 [3-甲基-5-(吡啶-2-基)-1-(嘧啶-5-基)-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯 (參見表 2, 實例 2-116)

a) [3-甲基-5-(吡啶-2-基)-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯的製備

1.170 g (23 mmol)水合肼加至由 5 g (21 mmol) 4-酮基-3-(吡啶-2-基羰基)戊酸甲酯於乙醇(50 ml)所形成的溶液中。混合物在回流的情況下加熱 7 小時，加至水中，及以乙酸乙酯萃取。合併的有機層經硫酸鎂乾燥、過濾和濃縮。得 2.290 g 產物(41.9%理論值)。

NMR (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz): 2.3 (s, 3H); 3.84 (s, 2H); 7.19 (m, 1H); 7.72 (m, 1H); 7.84 (m, 1H); 8.59 (m, 1H)。

b)

1.767 g (9.73 mmol)乙酸銅(II)和 1.049 ml (12.973 mmol)吡啶加至於 20 ml 二氯甲烷中之 1.5 g (6.486 mmol) [3-甲基-5-(吡啶-2-基)-1H-吡啶-4-基]乙酸甲酯。接著加入 1.607 g (12.973 mmol) 5-嘧啶基硼酸，混合物在 20°C 下攪拌 48 小時。將混合物倒入 1-莫耳濃度的 HCl 水溶液(10 ml)，並以二氯甲烷萃取。合併的有機層經硫酸鎂乾燥、過濾和濃縮。以製備型 HPLC 純化粗產物。得酯和酸的混合物，使此混合物於甲醇中且加上一滴硫酸在回流的情況下加熱 4 小時。將反應混合物倒入水(20 ml)中，中和及以二氯甲烷萃取。合併的有機層經硫酸鎂乾燥和濃縮，得 0.031 g 產物(1.47%理論值)。

NMR ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz): 2.38 (s, 3H); 3.57 (s, 2H); 3.71 (s, 3H); 7.32 (m, 1H); 7.46 (m, 1H); 7.79 (m, 1H); 8.61 (m, 1H); 8.63 (s, 2H); 9.04 (s, 1H)。

下表 1 至 12 所示的化合物係根據或類似上述實例所述方法而製備。

表 13 列示可根據上述的方法應用之式 (III) 的中間物。

表 1 至 13 中：

F、Cl、Br、I	=	根據原子的慣用化學符號分別表示氟、氯、溴和碘
Me	=	甲基
MeO 或 OMe	=	甲氧基
3,5-Me <sub>2</sub>	=	3,5-二甲基(例如作為苯環的取代基)
4,5-Cl <sub>2</sub>	=	4,5-二氯(例如作為苯環的取代基)
Et	=	乙基
Pr	=	nPr = 正丙基
iPr	=	異丙基
iOPr	=	O-iPr = iPrO = 異丙氧基
cyPr	=	環丙基
Bu	=	nBu = 正丁基 = 丁-1-基
iBu	=	異丁基 = 2-甲基丙-1-基
sBu	=	第二丁基
tBu	=	t-丁基 = 第三丁基 = 2-甲基丙-2-基
Ph	=	苯基

PhO	=	苯氧基
Ac	=	COCH <sub>3</sub> = 乙醯基
烯丙基	=	丙-2-烯-1-基
COOH	=	羧基
OSO <sub>2</sub> Me	=	-O-S(=O) <sub>2</sub> -CH <sub>3</sub> 、甲基磺醯氧基、甲磺酸酯
“(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub> = H”	=	未經取代的環(n = 0)

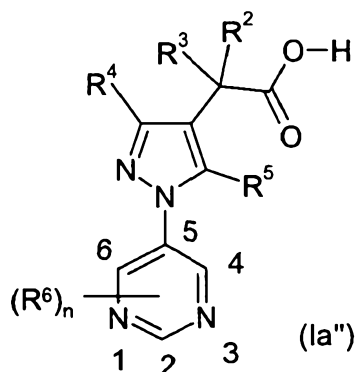
此外，應用慣用化學符號，例如，CH<sub>2</sub> 表示伸甲基，或 CF<sub>3</sub> 表示三氟甲基，或 OH 表示羥基。對應地，複合定義係由上述縮寫組成的定義。

表中化合物的物理數據(“數據”)，適當的話，列示於詳細的製備例(參見上文)或列示於表的末端。其中：

“NMR” = <sup>1</sup>H-NMR 光譜所得的數據(<sup>1</sup>H 核磁共振數據)

“m.p.” = 熔點

表 1： 式 (Ia'') 所示化合物



編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
1-1	H	H	Ph	Ph	H
1-2	H	H	Me	Ph	H
1-3	H	H	Me	5-I-2-噻吩基	H
1-4	H	H	Me	2-呋喃基	H
1-5	H	H	Me	Ph	2-OMe
1-6	Me	H	Me	Ph	4-Me
1-7	H	H	Me	Ph	2-Cl
1-8	H	H	Me	Ph	4-CF <sub>3</sub>
1-9	H	H	Me	Ph	2-CF <sub>3</sub>
1-10	H	H	Me	Ph	4-Me
1-11	H	H	Me	Ph	2,4-Me <sub>2</sub>
1-12	H	H	Me	Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
1-13	H	H	Me	4-MeO-Ph	4-Me
1-14	H	H	Me	4-MeO-Ph	H
1-15	Me	H	Me	Ph	H
1-16	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
1-17	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Cl
1-18	H	H	Me	4-Me-Ph	H
1-19	H	H	Me	3-Cl-Ph	H
1-20	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
1-21	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Me
1-22	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
1-23	H	H	Me	3-Cl-Ph	4-Me
1-24	H	H	Me	2-Cl-Ph	4-Me
1-25	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
1-26	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Me
1-27	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Me
1-28	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
1-29	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
1-30	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H
1-31	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Cl
1-32	H	H	Me	Ph	4-Cl
1-33	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
1-34	H	H	Me	4-tBu-Ph	4-Me
1-35	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	4-Me
1-36	H	H	Me	Ph	4-OMe
1-37	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-OMe
1-38	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
1-39	H	H	Me	4-F-Ph	4-Cl
1-40	H	H	Me	4-F-Ph	4-Me
1-41	H	H	Me	3-Me-Ph	4-Me
1-42	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	4-Me
1-43	H	H	Me	3-Br-Ph	4-Me
1-44	H	H	Me	4-Ph-Ph	4-Me
1-45	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	H
1-46	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	H
1-47	H	H	Me	Ph	4-SMe
1-48	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SMe
1-49	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
1-50	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	H
1-51	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	4-Me
1-52	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	4-Me
1-53	H	H	Me	2-吡啶基	4-Cl
1-54	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-F
1-55	H	H	Me	2-噻吩基	4-Me
1-56	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	4-Me
1-57	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	4-Me
1-58	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Me
1-59	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Cl
1-60	H	H	Me	3-噻吩基	4-Me
1-61	H	H	Me	2-噻吩基	H
1-62	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	H
1-63	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	H
1-64	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
1-65	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基	H
1-66	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
1-67	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	H
1-68	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	4-Me
1-69	H	H	Me	3-噻吩基	H
1-70	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-S(O)Me
1-71	H	H	Me	4-Br-Ph	4-Me
1-72	H	H	Me	1,3-苯並二噁茂-5-基	4-Me
1-73	H	H	Me	4-I-Ph	4-Me
1-74	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
1-75	H	H	Me	4-PhO-Ph	4-Me
1-76	H	H	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
1-77	H	H	Me	Ph	4-S(O)Me
1-78	H	H	H	Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
1-79	H	H	H	Ph	4-Me
1-80	H	H	Et	Ph	H
1-81	H	H	n-Pr	Ph	H
1-82	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	H
1-83	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	H
1-84	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	H
1-85	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	H
1-86	H	H	Cl	Ph	H
1-87	H	H	Et	Ph	4-Me
1-88	H	H	n-Pr	Ph	4-Me
1-89	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	4-Me
1-90	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	4-Me
1-91	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	4-Me
1-92	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	4-Me
1-93	H	H	Cl	Ph	4-Me
1-94	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
1-95	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
1-96	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Cl-Ph	H
1-97	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
1-98	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Cl-Ph	H
1-99	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
1-100	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
1-101	H	H	Et	4-Me-Ph	H
1-102	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H
1-103	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Me-Ph	H
1-104	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H
1-105	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Me-Ph	H
1-106	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H
1-107	H	H	Cl	4-Me-Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
1-108	H	H	Et	2-吡啶基	H
1-109	H	H	n-Pr	2-吡啶基	H
1-110	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	2-吡啶基	H
1-111	H	H	CHCl <sub>2</sub>	2-吡啶基	H
1-112	H	H	CH <sub>2</sub> F	2-吡啶基	H
1-113	H	H	CHF <sub>2</sub>	2-吡啶基	H
1-114	H	H	Cl	2-吡啶基	H
1-115	H	H	Me	2-吡啶基	H
1-116	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
1-117	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Cl
1-118	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Me
1-119	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
1-120	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Cl
1-121	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Me
1-122	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
1-123	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
1-124	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	4-Me
1-125	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
1-126	H	H	Me	4-CH <sub>2</sub> COOH-Ph	4-Me
1-127	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	4-Me
1-128	H	H	Me	4-Br-Ph	H
1-129	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	H
1-130	H	H	Me	3-Me-Ph	H
1-131	H	H	Me	4-F-Ph	H
1-132	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
1-133	H	H	Me	4-tBu-Ph	H
1-134	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
1-135	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	4-Me
1-136	H	H	Me	3-吡啶基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
1-137	H	H	Me	4-吡啶基	H
1-138	H	H	C(O)OMe	Ph	H
1-139	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
1-140	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SO <sub>2</sub> Me
1-141	H	H	Me	3-吡啶基	4-Me
1-142	H	H	Me	2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
1-143	H	H	Me	2-吡啶基	4-Me
1-144	H	H	H	4-Cl-Ph	4-Me
1-145	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
1-146	H	H	Me	Ph	2-Me
1-147	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
1-148	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Me
1-149	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Cl
1-150	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-F
1-151	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H
1-152	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H
1-153	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
1-154	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
1-155	H	H	Me	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基	H
1-156	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
1-157	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
1-158	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
1-159	H	H	CN	4-Cl-Ph	4-Me
1-160	H	H	CN	4-Me-Ph	H
1-161	H	H	CN	4-Me-Ph	4-Me
1-162	H	H	CN	Ph	H
1-163	H	H	CN	Ph	4-Me
1-164	H	H	CN	2-吡啶基	H
1-165	H	H	CN	3-吡啶基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
1-166	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H
1-167	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H
1-168	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
1-169	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H
1-170	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
1-171	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
1-172	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
1-173	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
1-174	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
1-175	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
1-176	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	H
1-177	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	4-Me
1-178	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	H
1-179	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	4-Me
1-180	H	H	甲醯基	Ph	H
1-181	H	H	甲醯基	Ph	4-Me
1-182	H	H	甲醯基	2-吡啶基	H
1-183	H	H	甲醯基	3-吡啶基	H
1-184	H	H	甲醯基	5-Cl-吡啶-2-基	H
1-185	H	H	甲醯基	5-Br-吡啶-2-基	H
1-186	H	H	甲醯基	5-F-吡啶-2-基	H
1-187	H	H	甲醯基	5-Me-吡啶-2-基	H
1-188	H	H	甲醯基	6-Me-吡啶-3-基	H
1-189	H	H	甲醯基	4-Me-吡啶-2-基	H
1-190	H	H	甲醯基	4-F-吡啶-2-基	H
1-191	H	H	甲醯基	4-Cl-吡啶-2-基	H
1-192	H	H	甲醯基	4-Br-吡啶-2-基	H
1-193	H	H	甲醯基	4-OMe-吡啶-2-基	H
1-194	H	H	CH <sub>2</sub> OH	5-Me-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
1-195	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Cl-Ph	H
1-196	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-吡啶-2-基	H
1-197	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-Ph	H
1-198	H	H	CH <sub>2</sub> OH	Ph	H
1-199	H	H	CH <sub>2</sub> OH	2-吡啶基	H
1-200	H	H	Me	2-噻唑基	H
1-201	H	H	Me	2-噻唑基	4-Cl
1-202	H	H	Me	2-噻唑基	4-Me
1-203	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
1-204	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Cl
1-205	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Me
1-206	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
1-207	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
1-208	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	4-Me
1-209	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
1-210	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
1-211	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	4-Me
1-212	H	H	Me	2-吡啶基	4-F
1-213	H	H	Me	2-吡嗪基	H
1-214	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
1-215	H	H	Me	2-吡嗪基	4-Me
1-216	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	H
1-217	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	4-Me
1-218	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
1-219	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	H
1-220	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	4-Me
1-221	H	H	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
1-222	H	H	Me	4,5-Cl <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
1-223	H	H	Me	2-嘧啶基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
1-224	H	H	Me	2-嘧啶基	4-Me
1-225	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
1-226	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
1-227	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
1-228	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
1-229	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	4-Me
1-230	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
1-231	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	4-Me
1-232	H	H	Me	3-噻嗪基	H
1-233	H	H	Me	6-Me-噻嗪-3-基	H
1-234	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基	H
1-235	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H
1-236	H	H	Me	異喹啉-3-基	H
1-237	H	H	Me	喹啉-2-基	H
1-238	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
1-239	H	H	Me	2-Me-吡啶-4-基	H
1-240	H	H	Me	4-Cl-6-Me-吡啶-2-基	H
1-241	H	H	Me	4-Br-3-Me-Ph	H
1-242	H	H	Me	5-Cl-吡啶-3-基	H
1-243	H	H	Me	5-烯丙基吡啶-2-基	H
1-244	H	H	Me	5-環丙基吡啶-2-基	H
1-245	H	H	Me	5-乙炔基吡啶-2-基	H
1-246	H	H	Me	5-Ph-吡啶-2-基	H
1-247	H	H	Me	5-I-吡啶-2-基	H
1-248	H	H	Me	5-I-嘧啶-2-基	H
1-249	H	H	Cl	4-F-Ph	H
1-250	H	H	Cl	3-吡啶基	H
1-251	H	H	Cl	5-Cl-吡啶-2-基	H
1-252	H	H	Cl	5-Br-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
1-253	H	H	Cl	5-F-吡啶-2-基	H
1-254	H	H	Cl	5-I-吡啶-2-基	H
1-255	H	H	Cl	5-Me-吡啶-2-基	H
1-256	H	H	Cl	6-Me-吡啶-3-基	H
1-257	H	H	Cl	4-Me-吡啶-2-基	H
1-258	H	H	Cl	4-F-吡啶-2-基	H
1-259	H	H	Cl	4-Cl-吡啶-2-基	H
1-260	H	H	Cl	4-Br-吡啶-2-基	H
1-261	H	H	Cl	4-OMe-吡啶-2-基	H
1-262	H	H	Cl	2-嘧啶基	H
1-263	H	H	Cl	5-F-嘧啶-2-基	H
1-264	H	H	Cl	5-Cl-嘧啶-2-基	H
1-265	H	H	Cl	5-Br-嘧啶-2-基	H
1-266	H	H	Cl	5-I-嘧啶-2-基	H
1-267	H	H	Cl	5-Me-嘧啶-2-基	H
1-268	H	H	Cl	5-Me-吡嗪-2-基	H
1-269	H	H	Cl	2-吡嗪基	H
1-270	H	H	Cl	異喹啉-3-基	H
1-271	H	H	Cl	喹啉-2-基	H
1-272	H	H	Cl	1,3-苯並噁唑-2-基	H
1-273	H	H	Cl	7-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
1-274	H	H	Cl	2-噁唑基	H
1-275	H	H	Cl	5-Br-噁唑-2-基	H
1-276	H	H	Cl	5-Me-噁唑-2-基	H
1-277	H	H	Cl	5-Cl-噁唑-2-基	H
1-278	H	H	Cl	2-噁吩基	H
1-279	H	H	Cl	3-Me-2-噁吩基	H
1-280	H	H	Cl	4-Me-2-噁吩基	H
1-281	H	H	Cl	5-Br-2-噁吩基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
1-282	H	H	Cl	5-Cl-2-噻吩基	H
1-283	H	H	Me	4-噻唑基	H
1-284	H	H	Me	3-Br-Me	H
1-285	H	H	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
1-286	H	H	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
1-287	H	H	Me	5-OSO <sub>2</sub> Me-吡啶-2-基	H
1-288	H	H	Me	6-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
1-289	H	H	Me	6-Br-1,3-苯並噻唑-2-基	H
1-290	H	H	Me	1,3-苯並噁唑-2-基	H
1-291	H	H	Me	6-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
1-292	H	H	Me	6-Br-1,3-苯並噁唑-2-基	H
1-293	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
1-294	H	H	Me	5-NH <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
1-295	H	H	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
1-296	H	H	Me	5-OCHF <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
1-297	H	H	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
1-298	H	H	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
1-299	H	H	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
1-300	H	H	Me	5-NMe <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H

此外，測得本發明之通式(I)化合物的 NMR 數據。代表化合物的 NMR 分別以 400 MHz 之 <sup>1</sup>H-NMR 光譜的形式記錄 (CDCl<sub>3</sub> 或 DMSO-D<sub>6</sub>) (<sup>1</sup>H 核磁共振數據)。部份例示化合物之特徵化學位移 δ (ppm) 示於下文：

NMR 化合物 1-116 (DMSO-D<sub>6</sub>, 400 MHz, δ ppm) :

2.28 (s, 3H) ; 3.54 (s, 2H) ; 7.61 (d, 1H) ; 8.11 (dd,

1H) ; 8.61 (*d*, 1H) ; 8.66 (*s*, 2H) ; 9.10 (*s*, 1H) 。 m.p. :  
234.3 °C 。

NMR 化合物 1-214 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz, δ ppm) :  
2.43 (*s*, 3H) ; 2.68 (*s*, 3H) ; 3.54 (*s*, 2H) ; 8.43 (*s*, 1H)  
; 8.55 (*s*, 1H) ; 8.70 (*s*, 2H) ; 9.15 (*s*, 1H) 。 m.p. :  
195.6 °C 。

NMR 化合物 1-236 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz, δ ppm) :  
2.47 (*s*, 3H) ; 3.56 (*s*, 2H) ; 7.39 (*m*, 1H) ; 7.69 (*m*,  
1H) ; 7.78-7.86 (*m*, 2H) ; 8.13 (*m*, 1H) ; 8.73 (*s*, 2H) ;  
9.14 (*s*, 1H) ) ; 9.40 (*s*, 1H) 。 m.p. : 103.9 °C 。

NMR 化合物 1-154 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz, δ ppm) :  
2.43 (*s*, 3H) ; 3.52 (*s*, 2H) ; 3.73 (*s*, 3H) ; 6.42 (*m*,  
1H) ; 6.98 (*m*, 1H) ; 8.57 (*m*, 1H) ; 8.72 (*s*, 2H) ; 9.18  
(*s*, 1H) ; 15.3 (*brs*, 1H) 。 m.p. : 173 °C 。

NMR 化合物 1-119 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz, δ ppm) :  
2.42 (*s*, 3H) ; 3.55 (*s*, 2H) ; 6.98 (*m*, 1H) ; 7.92 (*m*,  
1H) ; 8.70 (*s*, 2H) ; 8.83 (*m*, 1H) ; 9.19 (*s*, 1H) 。

NMR 化合物 1-210 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz, δ ppm) :  
2.22 (*s*, 3H) ; 2.43 (*s*, 3H) ; 2.66 (*s*, 3H) ; 3.50 (*s*, 2H)

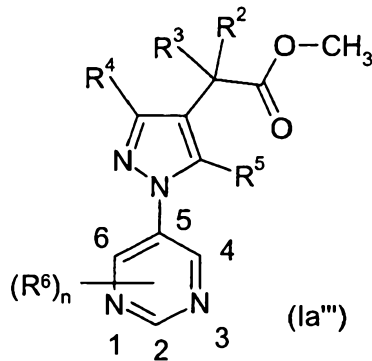
201011000

; 6.61 (s, 1H); 7.13 (s, 1H); 8.72 (s, 2H); 9.17 (s, 1H)。

NMR 化合物 1-28 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.38 (s, 3H); 3.44 (s, 2H); 7.20 (d, 2H); 7.41 (d, 2H)  
; 8.62 (s, 2H); 9.04 (s, 1H)。

表 2： 式 (Ia''') 所示化合物



編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
2-1	H	H	Ph	Ph	H
2-2	H	H	Me	Ph	H
2-3	H	H	Me	5-I-2-噻吩基	H
2-4	H	H	Me	2-呋喃基	H
2-5	H	H	Me	Ph	2-OMe
2-6	Me	H	Me	Ph	4-Me
2-7	H	H	Me	Ph	2-Cl
2-8	H	H	Me	Ph	4-CF <sub>3</sub>
2-9	H	H	Me	Ph	2-CF <sub>3</sub>
2-10	H	H	Me	Ph	4-Me
2-11	H	H	Me	Ph	2,4-Me <sub>2</sub>
2-12	H	H	Me	Ph	2,4-Cl <sub>2</sub>
2-13	H	H	Me	4-MeO-Ph	4-Me
2-14	H	H	Me	4-MeO-Ph	H
2-15	Me	H	Me	Ph	H
2-16	H	H	Me	4-Me-Ph	H
2-17	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
2-18	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Cl
2-19	H	H	Me	3-Cl-Ph	H
2-20	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
2-21	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Me
2-22	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
2-23	H	H	Me	3-Cl-Ph	4-Me
2-24	H	H	Me	2-Cl-Ph	4-Me
2-25	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
2-26	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Me
2-27	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Me
2-28	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
2-29	H	H	Me	4-Cl-Ph	2-Cl
2-30	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
2-31	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H
2-32	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Cl
2-33	H	H	Me	Ph	4-Cl
2-34	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
2-35	H	H	Me	4-tBu-Ph	4-Me
2-36	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	4-Me
2-37	H	H	Me	Ph	4-OMe
2-38	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-OMe
2-39	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
2-40	H	H	Me	4-F-Ph	4-Me
2-41	H	H	Me	4-F-Ph	4-Cl
2-42	H	H	Me	3-Me-Ph	4-Me
2-43	H	H	Me	4-COOH-Ph	4-Me
2-44	H	H	Me	3-Br-Ph	4-Me
2-45	H	H	Me	4-Ph-Ph	4-Me
2-46	H	H	Me	4-COOH-Ph	H
2-47	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	H
2-48	H	H	Me	Ph	4-SMe
2-49	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SMe

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
2-50	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H
2-51	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	H
2-52	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	4-Me
2-53	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	4-Me
2-54	H	H	Me	2-吡啶基	4-Cl
2-55	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-F
2-56	H	H	Me	2-噻吩基	4-Me
2-57	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	4-Me
2-58	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	4-Me
2-59	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Me
2-60	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Cl
2-61	H	H	Me	3-噻吩基	4-Me
2-62	H	H	Me	2-噻吩基	H
2-63	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	H
2-64	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	H
2-65	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
2-66	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基	H
2-67	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
2-68	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	H
2-69	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	4-Me
2-70	H	H	Me	3-噻吩基	H
2-71	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-S(O)Me
2-72	H	H	Me	4-Br-Ph	4-Me
2-73	H	H	Me	1,3-苯並二噁茂-5-基	4-Me
2-74	H	H	Me	4-I-Ph	4-Me
2-75	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
2-76	H	H	Me	4-PhO-Ph	4-Me
2-77	H	H	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
2-78	H	H	Me	Ph	4-S(O)Me

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
2-79	H	H	H	Ph	H
2-80	H	H	H	Ph	4-Me
2-81	H	H	Et	Ph	H
2-82	H	H	n-Pr	Ph	H
2-83	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	H
2-84	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	H
2-85	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	H
2-86	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	H
2-87	H	H	Cl	Ph	H
2-88	H	H	Et	Ph	4-Me
2-89	H	H	n-Pr	Ph	4-Me
2-90	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	4-Me
2-91	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	4-Me
2-92	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	4-Me
2-93	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	4-Me
2-94	H	H	Cl	Ph	4-Me
2-95	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
2-96	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
2-97	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Cl-Ph	H
2-98	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
2-99	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Cl-Ph	H
2-100	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
2-101	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
2-102	H	H	Et	4-Me-Ph	H
2-103	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H
2-104	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Me-Ph	H
2-105	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H
2-106	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Me-Ph	H
2-107	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
2-108	H	H	Cl	4-Me-Ph	H
2-109	H	H	Et	2-吡啶基	H
2-110	H	H	n-Pr	2-吡啶基	H
2-111	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	2-吡啶基	H
2-112	H	H	CHCl <sub>2</sub>	2-吡啶基	H
2-113	H	H	CH <sub>2</sub> F	2-吡啶基	H
2-114	H	H	CHF <sub>2</sub>	2-吡啶基	H
2-115	H	H	Cl	2-吡啶基	H
2-116	H	H	Me	2-吡啶基	H
2-117	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
2-118	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Cl
2-119	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Me
2-120	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
2-121	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Cl
2-122	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Me
2-123	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
2-124	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
2-125	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	4-Me
2-126	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
2-127	H	H	Me	4-(CH <sub>2</sub> COOH)-Ph	4-Me
2-128	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	4-Me
2-129	H	H	Me	4-Br-Ph	4-Me
2-130	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	H
2-131	H	H	Me	3-Me-Ph	H
2-132	H	H	Me	4-F-Ph	H
2-133	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
2-134	H	H	Me	4-tBu-Ph	H
2-135	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
2-136	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	4-Me

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
2-137	H	H	Me	3-吡啶基	H
2-138	H	H	Me	4-吡啶基	H
2-139	H	H	C(O)OMe	Ph	H
2-140	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
2-141	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SO <sub>2</sub> Me
2-142	H	H	Me	3-吡啶基	4-Me
2-143	H	H	Me	2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
2-144	H	H	Me	2-吡啶基	4-Me
2-145	H	H	H	4-Cl-Ph	4-Me
2-146	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
2-147	H	H	Me	Ph	2-Me
2-148	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
2-149	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Me
2-150	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Cl
2-151	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-F
2-152	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H
2-153	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H
2-154	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
2-155	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
2-156	H	H	Me	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基	H
2-157	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
2-158	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
2-159	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
2-160	H	H	CN	4-Cl-Ph	4-Me
2-161	H	H	CN	4-Me-Ph	H
2-162	H	H	CN	4-Me-Ph	4-Me
2-163	H	H	CN	Ph	H
2-164	H	H	CN	Ph	4-Me
2-165	H	H	CN	2-吡啶基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
2-166	H	H	CN	3-吡啶基	H
2-167	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H
2-168	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H
2-169	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
2-170	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H
2-171	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
2-172	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
2-173	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
2-174	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
2-175	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
2-176	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
2-177	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	H
2-178	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	4-Me
2-179	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	H
2-180	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	4-Me
2-181	H	H	甲醯基	Ph	H
2-182	H	H	甲醯基	Ph	4-Me
2-183	H	H	甲醯基	2-吡啶基	H
2-184	H	H	甲醯基	3-吡啶基	H
2-185	H	H	甲醯基	5-Cl-吡啶-2-基	H
2-186	H	H	甲醯基	5-Br-吡啶-2-基	H
2-187	H	H	甲醯基	5-F-吡啶-2-基	H
2-188	H	H	甲醯基	5-Me-吡啶-2-基	H
2-189	H	H	甲醯基	6-Me-吡啶-3-基	H
2-190	H	H	甲醯基	4-Me-吡啶-2-基	H
2-191	H	H	甲醯基	4-F-吡啶-2-基	H
2-192	H	H	甲醯基	4-Cl-吡啶-2-基	H
2-193	H	H	甲醯基	4-Br-吡啶-2-基	H
2-194	H	H	甲醯基	4-OMe-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
2-195	H	H	CH <sub>2</sub> OH	5-Me-吡啶-2-基	H
2-196	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Cl-Ph	H
2-197	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-吡啶-2-基	H
2-198	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-Ph	H
2-199	H	H	CH <sub>2</sub> OH	Ph	H
2-200	H	H	CH <sub>2</sub> OH	2-吡啶基	H
2-201	H	H	Me	2-噻唑基	H
2-202	H	H	Me	2-噻唑基	4-Cl
2-203	H	H	Me	2-噻唑基	4-Me
2-204	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
2-205	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Cl
2-206	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Me
2-207	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
2-208	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
2-209	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	4-Me
2-210	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
2-211	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
2-212	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	4-Me
2-213	H	H	Me	2-吡啶基	4-F
2-214	H	H	Me	2-吡嗪基	H
2-215	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
2-216	H	H	Me	2-吡嗪基	4-Me
2-217	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	H
2-218	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	4-Me
2-219	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
2-220	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	H
2-221	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	4-Me
2-222	H	H	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
2-223	H	H	Me	4,5-Cl <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
2-224	H	H	Me	2-嘧啶基	H
2-225	H	H	Me	2-嘧啶基	4-Me
2-226	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
2-227	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
2-228	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
2-229	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
2-230	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	4-Me
2-231	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
2-232	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	4-Me
2-233	H	H	Me	3-噻嗪基	H
2-234	H	H	Me	6-Me-噻嗪-3-基	H
2-235	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基	H
2-236	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H
2-237	H	H	Me	4-Cl-Ph	2-OMe
2-238	H	H	Me	2-吡啶基	2-SO <sub>2</sub> Me
2-239	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
2-240	H	H	Me	4-Br-Ph	H
2-241	H	H	Me	異喹啉-3-基	H
2-242	H	H	Me	喹啉-2-基	H
2-243	H	H	Me	4-NO <sub>2</sub> -Ph	H
2-244	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
2-245	H	H	Me	2-Me-吡啶-4-基	H
2-246	H	H	Me	4-Cl-6-Me-吡啶-2-基	H
2-247	H	H	Me	4-Br-3-Me-Ph	H
2-248	H	H	Me	5-Cl-吡啶-3-基	H
2-249	H	H	Me	5-烯丙基吡啶-2-基	H
2-250	H	H	Me	5-環丙基吡啶-2-基	H
2-251	H	H	Me	5-乙炔基吡啶-2-基	H
2-252	H	H	Me	5-Ph-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
2-253	H	H	Me	5-I-吡啶-2-基	H
2-254	H	H	Me	5-I-嘧啶-2-基	H
2-255	H	H	Cl	4-F-Ph	H
2-256	H	H	Cl	3-吡啶基	H
2-257	H	H	Cl	5-Cl-吡啶-2-基	H
2-258	H	H	Cl	5-Br-吡啶-2-基	H
2-259	H	H	Cl	5-F-吡啶-2-基	H
2-260	H	H	Cl	5-I-吡啶-2-基	H
2-261	H	H	Cl	5-Me-吡啶-2-基	H
2-262	H	H	Cl	6-Me-吡啶-3-基	H
2-263	H	H	Cl	4-Me-吡啶-2-基	H
2-264	H	H	Cl	4-F-吡啶-2-基	H
2-265	H	H	Cl	4-Cl-吡啶-2-基	H
2-266	H	H	Cl	4-Br-吡啶-2-基	H
2-267	H	H	Cl	4-OMe-吡啶-2-基	H
2-268	H	H	Cl	2-嘧啶基	H
2-269	H	H	Cl	5-F-嘧啶-2-基	H
2-270	H	H	Cl	5-Cl-嘧啶-2-基	H
2-271	H	H	Cl	5-Br-嘧啶-2-基	H
2-272	H	H	Cl	5-I-嘧啶-2-基	H
2-273	H	H	Cl	5-Me-嘧啶-2-基	H
2-274	H	H	Cl	5-Me-吡嗪-2-基	H
2-275	H	H	Cl	2-吡嗪基	H
2-276	H	H	Cl	異喹啉-3-基	H
2-277	H	H	Cl	喹啉-2-基	H
2-278	H	H	Cl	1,3-苯並噻唑-2-基	H
2-279	H	H	Cl	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
2-280	H	H	Cl	2-噻唑基	H
2-281	H	H	Cl	5-Br-噻唑-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
2-282	H	H	Cl	5-Me-噻唑-2-基	H
2-283	H	H	Cl	5-Cl-噻唑-2-基	H
2-284	H	H	Cl	2-噻吩基	H
2-285	H	H	Cl	3-Me-2-噻吩基	H
2-286	H	H	Cl	4-Me-2-噻吩基	H
2-287	H	H	Cl	5-Br-2-噻吩基	H
2-288	H	H	Cl	5-Cl-2-噻吩基	H
2-289	H	H	Me	3-Br-Ph	H
2-290	H	H	Me	4-噻唑基	H
2-291	H	H	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
2-292	H	H	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
2-293	H	H	Me	5-OSO <sub>2</sub> Me-吡啶-2-基	H
2-294	H	H	Me	6-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
2-295	H	H	Me	6-Br-1,3-苯並噻唑-2-基	H
2-296	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	H
2-297	H	H	Me	6-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
2-298	H	H	Me	6-Br-1,3-苯並噻唑-2-基	H
2-299	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
2-300	H	H	Me	5-NH <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
2-301	H	H	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
2-302	H	H	Me	5-OCHF <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
2-303	H	H	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
2-304	H	H	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
2-305	H	H	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
2-306	H	H	Me	5-NMe <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H

此外，測得本發明之通式(I)化合物的 NMR 數據。代表化合物的 NMR 分別以 400 MHz 之 <sup>1</sup>H-NMR 光譜的形式

記錄 (CDCl<sub>3</sub>) (<sup>1</sup>H 核磁共振數據)。部份例示化合物之特徵化學位移  $\delta$  (ppm) 示於下文：

NMR 化合物 2-237 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

2.32 (*s*, 3H) ; 3.39 (*s*, 2H) ; 3.70 (*s*, 3H) ; 4.00 (*s*, 3H)  
; 7.18 (*d*, 2H) ; 7.39 (*d*, 2H) ; 8.38 (*s*, 2H)。

NMR 化合物 2-117 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

2.35 (*s*, 3H) ; 3.52 (*s*, 2H) ; 3.71 (*s*, 3H) ; 7.45 (*d*, 1H)  
; 7.77 (*dd*, 1H) ; 8.53 (*d*, 1H) ; 8.65 (*s*, 2H) ; 9.08 (*s*,  
1H)。

NMR 化合物 2-120 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

2.38 (*s*, 3H) ; 3.54 (*s*, 2H) ; 3.72 (*s*, 3H) ; 7.39 (*d*, 1H)  
; 7.92 (*dd*, 1H) ; 8.64 (*d*, 1H) ; 8.67 (*s*, 2H) ; 9.09 (*s*,  
1H)。

NMR 化合物 2-28 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

2.36 (*s*, 3H) ; 3.40 (*s*, 2H) ; 3.71 (*s*, 3H) ; 7.20 (*d*, 2H)  
; 7.41 (*d*, 2H) ; 8.63 (*s*, 2H) ; 9.03 (*s*, 1H)。

NMR 化合物 2-29 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

2.34 (*s*, 3H) ; 3.38 (*s*, 2H) ; 3.72 (*s*, 3H) ; 7.20 (*d*, 2H)  
; 7.44 (*d*, 2H) ; 8.50 (*s*, 2H)。

NMR 化合物 2-116 ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

2.38 (s, 3H) ; 3.57 (s, 2H) ; 3.71 (s, 3H) ; 7.32 (m, 1H) ; 7.46 (m, 1H) ; 7.69 (m, 1H) ; 8.61 (m, 1H) ; 8.63 (s, 2H) ; 9.04 (s, 1H)。

NMR 化合物 2-238 ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

2.38 (s, 3H) ; 3.33 (s, 3H) ; 3.52 (s, 2H) ; 3.72 (s, 3H) ; 7.32 (m, 1H) ; 7.58 (m, 1H) ; 7.85 (m, 1H) ; 8.62 (m, 1H) ; 8.75 (s, 2H)。

NMR 化合物 2-239 ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

2.38 (s, 3H) ; 2.39 (s, 3H) ; 3.57 (s, 2H) ; 3.73 (s, 3H) ; 7.14 (d, 1H) ; 7.26 (s, 1H) ; 8.46 (d, 1H) ; 8.67 (s, 2H) ; 9.05 (s, 1H)。

NMR 化合物 2-215 ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

2.38 (s, 3H) ; 2.61 (s, 3H) ; 3.56 (s, 2H) ; 3.72 (s, 3H) ; 8.43 (s, 1H) ; 8.60 (s, 1H) ; 8.68 (s, 2H) ; 9.09 (s, 1H)。

m.p. : 193 °C。

NMR 化合物 2-135 ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

2.35 (s, 3H) ; 2.36 (s, 3H) ; 3.40 (s, 2H) ; 3.72 (s, 3H) ; 7.00 (m, 1H) ; 7.11 (m, 1H) ; 7.39 (m, 1H) ; 8.62 (s, 1H)。

2H) ; 9.02 (s , 1H) 。

NMR 化合物 2-16 (CDCl<sub>3</sub> , 400 MHz ,  $\delta$  ppm) :

2.34 (s , 3H) ; 2.39 (s , 3H) ; 3.41 (s , 2H) ; 3.71 (s , 3H)  
; 7.11 (d , 2H) ; 7.22 (d , 2H) ; 8.63 (s , 2H) ; 9.01 (s ,  
1H) 。

NMR 化合物 2-132 (CDCl<sub>3</sub> , 400 MHz ,  $\delta$  ppm) :

2.36 (s , 3H) ; 3.39 (s , 2H) ; 3.71 (s , 3H) ; 7.12 (m ,  
2H) ; 7.25 (m , 2H) ; 8.65 (brs , 2H) ; 9.05 (brs , 1H) 。

NMR 化合物 2-148 (CDCl<sub>3</sub> , 400 MHz ,  $\delta$  ppm) :

2.39 (s , 3H) ; 2.40 (s , 3H) ; 3.57 (s , 2H) ; 3.74 (s , 3H)  
; 7.14 (dd , 2H) ; 7.26 (d , 2H) ; 8.47 (d , 1H) ; 8.66 (s ,  
2H) ; 9.05 (s , 1H) 。

NMR 化合物 2-240 (CDCl<sub>3</sub> , 400 MHz ,  $\delta$  ppm) :

2.37 (s , 3H) ; 3.39 (s , 2H) ; 3.72 (s , 3H) ; 7.13 (d , 2H)  
; 7.58 (d , 2H) ; 8.63 (s , 2H) ; 9.04 (s , 1H) 。

NMR 化合物 2-65 (CDCl<sub>3</sub> , 400 MHz ,  $\delta$  ppm) :

2.33 (s , 3H) ; 3.48 (s , 2H) ; 3.72 (s , 3H) ; 6.87 (d , 2H)  
; 6.93 (d , 2H) ; 8.75 (brs , 2H) ; 9.11 (brs , 1H) 。

NMR 化合物 2-64 ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

2.25 (s, 3H) ; 2.33 (s, 3H) ; 3.48 (s, 2H) ; 3.72 (s, 3H)  
; 6.85 (d, 2H) ; 7.05 (d, 2H) ; 8.73 (brs, 2H) ; 9.09  
(brs, 1H)。

NMR 化合物 2-47 ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

2.28 (s, 6H) ; 2.35 (s, 3H) ; 3.41 (s, 2H) ; 3.70 (s, 3H)  
; 6.82 (s, 2H) ; 7.05 (s, 1H) ; 8.63 (s, 2H) ; 9.01 (s,  
1H)。

NMR 化合物 2-241 ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

2.40 (s, 3H) ; 3.59 (s, 2H) ; 3.73 (s, 3H) ; 7.72 (m,  
1H) ; 7.78 (m, 1H) ; 7.87 (m, 1H) ; 7.92 (s, 1H) ; 8.01  
(m, 1H) ; 8.67 (s, 2H) ; 9.02 (s, 1H) ; 9.18 (s, 1H)。  
m.p. : 100.7 °C。

NMR 化合物 2-217 ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

2.48 (s, 3H) ; 3.71 (s, 3H) ; 3.81 (s, 2H) ; 7.43 (t, 1H)  
; 7.51 (t, 1H) ; 7.89 (d, 1H) ; 8.00 (d, 1H) ; 8.82 (s,  
2H) ; 9.17 (s, 1H)。

NMR 化合物 2-243 ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

2.38 (s, 3H) ; 3.42 (s, 2H) ; 3.73 (s, 3H) ; 7.48 (d, 2H)  
; 8.30 (d, 2H) ; 8.61 (s, 2H) ; 9.08 (s, 1H)。

NMR 化合物 2-68 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.33 (s, 3H); 3.48 (s, 2H); 3.72 (s, 3H); 6.83 (d, 2H)  
; 7.08 (d, 2H); 8.73 (s, 2H); 9.11 (s, 1H)。

NMR 化合物 2-224 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.37 (s, 3H); 3.68 (s, 3H); 3.96 (s, 2H); 7.17 (t, 1H)  
; 8.64 (d, 2H); 8.74 (s, 2H); 9.14 (s, 1H)。

NMR 化合物 2-2 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.36 (s, 3H); 3.41 (s, 2H); 3.70 (s, 3H); 7.24 (m,  
2H); 7.43 (m, 3H); 8.61 (s, 2H); 9.01 (s, 1H)。

NMR 化合物 2-289 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.36 (s, 3H); 3.41 (s, 2H); 3.72 (s, 3H); 7.14 (m,  
1H); 7.29 (m, 1H); 7.44 (m, 1H); 7.58 (m, 1H); 8.63  
(s, 2H); 9.03 (s, 1H)。

NMR 化合物 2-247 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.34 (s, 3H); 2.37 (s, 3H); 3.39 (s, 2H); 3.71 (s, 3H)  
; 6.92 (m, 1H); 7.13 (m, 1H); 7.58 (m, 1H); 8.64 (s,  
2H); 9.04 (s, 1H)。

NMR 化合物 2-124 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.38 (s, 3H); 2.39 (s, 3H); 3.54 (s, 2H); 3.70 (s, 3H)  
; 7.33 (m, 1H); 7.59 (m, 1H); 8.42 (s, 1H); 8.63 (s,  
2H); 9.03 (s, 1H)。

NMR 化合物 2-155 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.38 (s, 3H); 3.55 (s, 2H); 3.72 (s, 3H); 3.86 (s, 3H)  
; 6.82 (m, 1H); 7.10 (m, 1H); 8.39 (m, 1H); 8.64 (s,  
2H); 9.04 (s, 1H)。 m.p.: 161.7 °C。

NMR 化合物 2-249 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.37 (s, 3H); 3.56 (s, 2H); 3.71 (s, 3H); 5.48 (m,  
1H); 5.88 (m, 1H); 6.71 (m, 1H); 7.41 (m, 1H); 7.80  
(m, 1H); 8.58 (m, 1H); 8.65 (s, 2H); 9.05 (s, 1H)。

NMR 化合物 2-242 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.40 (s, 3H); 3.68 (s, 2H); 3.69 (s, 3H); 7.43 (m,  
1H); 7.61 (m, 1H); 7.72 (m, 1H); 7.84 (m, 1H); 7.95  
(m, 1H); 8.21 (m, 1H); 8.69 (s, 2H); 9.04 (s, 1H)。

NMR 化合物 2-290 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.39 (s, 3H); 3.53 (s, 2H); 3.75 (s, 3H); 7.75 (s, 1H)  
; 8.68 (s, 2H); 8.83 (s, 1H); 9.09 (s, 1H)。

NMR 化合物 2-211 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.32 (s, 3H); 2.35 (s, 3H); 2.40 (s, 3H); 3.54 (s, 2H)  
; 3.71 (s, 3H); 7.00 (s, 1H); 7.06 (s, 1H); 8.65 (s,  
2H); 9.03 (s, 1H)。

NMR 化合物 2-66 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.32 (s, 3H); 2.48 (s, 3H); 3.48 (s, 2H); 3.72 (s, 3H)  
; 6.72 (d, 1H); 6.82 (d, 1H); 8.72 (s, 2H); 9.08 (s,  
1H)。

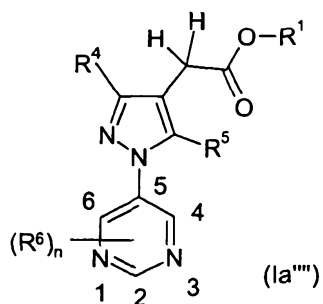
NMR 化合物 2-219 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.39 (s, 3H); 3.73 (s, 3H); 3.82 (s, 2H); 7.43 (m,  
1H); 7.47 (m, 1H); 7.89 (m, 1H); 8.83 (s, 2H); 9.19  
(s, 1H)。

NMR 化合物 2-244 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.35 (s, 3H); 3.40 (s, 2H); 3.72 (s, 3H); 7.17 (d, 2H)  
; 7.43 (t, 1H); 8.64 (s, 2H); 9.09 (s, 1H)。

表 3： 式 (Ia''''') 所示化合物



編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-1	Et	Me	Ph	H
3-2	Et	Me	Ph	4-Me
3-3	Et	Me	3-Cl-Ph	H
3-4	Et	Me	4-Cl-Ph	H
3-5	Et	Me	4-Cl-Ph	4-Me
3-6	Et	Me	2-噻吩基	H
3-7	Et	Me	3-噻吩基	H
3-8	Et	Me	3-Me-2-噻吩基	H
3-9	Et	Me	4-Me-2-噻吩基	H
3-10	Et	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-11	Et	Me	5-Br-2-噻吩基	4-Me
3-12	Et	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-13	Et	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Me
3-14	Et	Me	5-I-2-噻吩基	H
3-15	Et	Me	5-Me-2-噻吩基	H
3-16	Et	Me	3-吡啶基	H
3-17	Et	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
3-18	Et	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
3-19	Et	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-20	Et	Me	4-Me-Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-21	Et	Me	4-Me-Ph	4-Me
3-22	Et	Me	4-Br-Ph	H
3-23	Et	Me	4-F-Ph	H
3-24	Et	Me	4-F-Ph	4-Me
3-25	Et	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-26	Et	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-27	Et	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-28	Et	Me	5-F-吡啶-2-基	4-Me
3-29	Et	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Me
3-30	Et	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Me
3-31	Et	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-32	Et	Me	5-Me-吡啶-2-基	4-Me
3-33	Et	Me	2-吡啶基	4-Me
3-34	Et	Me	2-吡啶基	H
3-35	Et	Me	4-吡啶基	H
3-36	Et	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
3-37	Et	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Me
3-38	Et	Me	2-噻唑基	H
3-39	Et	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
3-40	Et	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-41	Et	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-42	Et	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
3-43	Et	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
3-44	Et	Me	4,5-Cl <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
3-45	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-46	Et	Me	2-吡嗪基	H
3-47	Et	Me	2-嘧啶基	H
3-48	Et	Me	2-嘧啶基	4-Me
3-49	Et	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-50	Et	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
3-51	Et	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
3-52	Et	Me	5-Me-嘧啶-2-基	4-Me
3-53	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
3-54	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	4-Me
3-55	Et	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-56	Et	Me	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-57	Et	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡唑-3-基	H
3-58	Et	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
3-59	Et	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
3-60	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
3-61	Et	Me	3-噻嗪基	H
3-62	Et	Me	6-Me-噻嗪-3-基	H
3-63	Et	Me	3-(1,2,4)-三嗪基	H
3-64	Et	Me	6-Me-(1,2,4)-三嗪-3-基	H
3-65	Pr	Me	Ph	H
3-66	Pr	Me	4-Cl-Ph	H
3-67	Pr	Me	2-噻吩基	H
3-68	Pr	Me	3-吡啶基	H
3-69	Pr	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-70	Pr	Me	4-Me-Ph	H
3-71	Pr	Me	4-Br-Ph	H
3-72	Pr	Me	4-F-Ph	H
3-73	Pr	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-74	Pr	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-75	Pr	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-76	Pr	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-77	Pr	Me	2-吡啶基	H
3-78	Pr	Me	4-吡啶基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-79	i-Pr	Me	Ph	H
3-80	i-Pr	Me	4-Cl-Ph	H
3-81	i-Pr	Me	2-噻吩基	H
3-82	i-Pr	Me	3-吡啶基	H
3-83	i-Pr	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-84	i-Pr	Me	4-Me-Ph	H
3-85	i-Pr	Me	4-Br-Ph	H
3-86	i-Pr	Me	4-F-Ph	H
3-87	i-Pr	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-88	i-Pr	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-89	i-Pr	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-90	i-Pr	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-91	i-Pr	Me	2-吡啶基	H
3-92	i-Pr	Me	4-吡啶基	H
3-93	CH <sub>2</sub> Ph	Me	Ph	H
3-94	CH <sub>2</sub> Ph	Me	4-Cl-Ph	H
3-95	CH <sub>2</sub> Ph	Me	2-噻吩基	H
3-96	CH <sub>2</sub> Ph	Me	2-吡啶基	H
3-97	丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
3-98	丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-99	丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-100	丙-2-炔-1-基	Me	3-噻吩基	H
3-101	丙-2-炔-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
3-102	丙-2-炔-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
3-103	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-104	丙-2-炔-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
3-105	丙-2-炔-1-基	Me	3-吡啶基	H
3-106	丙-2-炔-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
3-107	丙-2-炔-1-基	H	Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-108	丙-2-炔-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-109	丙-2-炔-1-基	Me	4-Me-Ph	H
3-110	丙-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-111	丙-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
3-112	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-113	丙-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-114	丙-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-115	丙-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-116	丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-117	丙-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
3-118	丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
3-119	丙-2-炔-1-基	Me	Ph	4-Me
3-120	環丙基甲基	Me	Ph	H
3-121	環丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-122	環丙基甲基	Me	2-噻吩基	H
3-123	環丙基甲基	Me	3-噻吩基	H
3-124	環丙基甲基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
3-125	環丙基甲基	Me	3-吡啶基	H
3-126	環丙基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-127	環丙基甲基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
3-128	環丙基甲基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
3-129	環丙基甲基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
3-130	環丙基甲基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
3-131	環丙基甲基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-132	環丙基甲基	Me	4-Me-Ph	H
3-133	環丙基甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-134	環丙基甲基	Me	4-F-Ph	H
3-135	環丙基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-136	環丙基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-137	環丙基甲基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-138	環丙基甲基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-139	環丙基甲基	Me	2-吡啶基	H
3-140	環丙基甲基	Me	4-吡啶基	H
3-141	環丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
3-142	環丙基甲基	Me	Ph	4-Me
3-143	環丙基甲基	H	Ph	H
3-144	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
3-145	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-146	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-147	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-148	(1-甲基環丙基)甲基	Me	Ph	H
3-149	(1-甲基環丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-150	(1-甲基環丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H
3-151	(1-甲基環丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H
3-152	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
3-153	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-154	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-155	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-156	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	Ph	H
3-157	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-158	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H
3-159	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H
3-160	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
3-161	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-162	丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-163	丁-2-炔-1-基	Me	3-噻吩基	H
3-164	丁-2-炔-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
3-165	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-166	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-167	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
3-168	丁-2-炔-1-基	Me	3-吡啶基	H
3-169	丁-2-炔-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
3-170	丁-2-炔-1-基	H	Ph	H
3-171	丁-2-炔-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-172	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-Ph	H
3-173	丁-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-174	丁-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
3-175	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-176	丁-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-177	丁-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-178	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-179	丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-180	丁-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
3-181	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
3-182	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	4-Me
3-183	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
3-184	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-185	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-186	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-187	1-環丙基乙基	Me	Ph	H
3-188	1-環丙基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-189	1-環丙基乙基	Me	2-噻吩基	H
3-190	1-環丙基乙基	Me	2-吡啶基	H
3-191	烯丙基	Me	Ph	H
3-192	烯丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-193	烯丙基	Me	2-噻吩基	H
3-194	烯丙基	Me	2-吡啶基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-195	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H
3-196	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-197	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-198	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-199	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
3-200	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-201	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-202	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-203	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H
3-204	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-205	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-206	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-207	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
3-208	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-209	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-210	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-211	環丁基甲基	Me	Ph	H
3-212	環丁基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-213	環丁基甲基	Me	2-噻吩基	H
3-214	環丁基甲基	Me	2-吡啶基	H
3-215	環戊基甲基	Me	Ph	H
3-216	環戊基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-217	環戊基甲基	Me	2-噻吩基	H
3-218	環戊基甲基	Me	2-吡啶基	H
3-219	環己基甲基	Me	Ph	H
3-220	環己基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-221	環己基甲基	Me	2-噻吩基	H
3-222	環己基甲基	Me	2-吡啶基	H
3-223	丁-3-烯-1-基	Me	Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-224	丁-3-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-225	丁-3-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-226	丁-3-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-227	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
3-228	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-229	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
3-230	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	3-噻吩基	H
3-231	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
3-232	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
3-233	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-234	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
3-235	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	3-吡啶基	H
3-236	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
3-237	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
3-238	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-239	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-Ph	H
3-240	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-241	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-F-Ph	H
3-242	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-243	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-244	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-245	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-246	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
3-247	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-吡啶基	H
3-248	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
3-249	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	Ph	4-Me
3-250	2-氯丙-2-烯-1-基	H	Ph	H
3-251	2-甲氧基乙基	Me	Ph	H
3-252	2-甲氧基乙基	Me	4-Cl-Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-253	2-甲氧基乙基	Me	2-噻吩基	H
3-254	2-甲氧基乙基	Me	2-吡啶基	H
3-255	四氫呋喃-2-基甲基	Me	Ph	H
3-256	四氫呋喃-2-基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-257	四氫呋喃-2-基甲基	Me	2-噻吩基	H
3-258	四氫呋喃-2-基甲基	Me	2-吡啶基	H
3-259	2-(二甲基胺基)乙基	Me	Ph	H
3-260	2-(二甲基胺基)乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-261	2-(二甲基胺基)乙基	Me	2-噻吩基	H
3-262	2-(二甲基胺基)乙基	Me	2-吡啶基	H
3-263	氧雜環丁烷-3-基	Me	Ph	H
3-264	氧雜環丁烷-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-265	氧雜環丁烷-3-基	Me	2-噻吩基	H
3-266	氧雜環丁烷-3-基	Me	2-吡啶基	H
3-267	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	Ph	H
3-268	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-269	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	2-噻吩基	H
3-270	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	2-吡啶基	H
3-271	2,2,2-三氟乙基	Me	Ph	H
3-272	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-273	2,2,2-三氟乙基	Me	2-噻吩基	H
3-274	2,2,2-三氟乙基	Me	3-吡啶基	H
3-275	2,2,2-三氟乙基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-276	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Me-Ph	H
3-277	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-278	2,2,2-三氟乙基	Me	4-F-Ph	H
3-279	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-280	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-281	2,2,2-三氟乙基	Me	5-F-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-282	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-283	2,2,2-三氟乙基	Me	2-吡啶基	H
3-284	2,2,2-三氟乙基	Me	4-吡啶基	H
3-285	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	Ph	H
3-286	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
3-287	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	2-噻吩基	H
3-288	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	3-吡啶基	H
3-289	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-290	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
3-291	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
3-292	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-F-Ph	H
3-293	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-294	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-295	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-296	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-297	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	2-吡啶基	H
3-298	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-吡啶基	H
3-299	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	Ph	H
3-300	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
3-301	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	2-噻吩基	H
3-302	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	3-吡啶基	H
3-303	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-304	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
3-305	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
3-306	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-F-Ph	H
3-307	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-308	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-309	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-310	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-311	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	2-吡啶基	H
3-312	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-吡啶基	H
3-313	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	Ph	H
3-314	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
3-315	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	2-噻吩基	H
3-316	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	3-吡啶基	H
3-317	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-318	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
3-319	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
3-320	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-F-Ph	H
3-321	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-322	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-323	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-324	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-325	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	2-吡啶基	H
3-326	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-吡啶基	H
3-327	2,2-二氟乙基	Me	Ph	H
3-328	2,2-二氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-329	2,2-二氟乙基	Me	2-噻吩基	H
3-330	2,2-二氟乙基	Me	2-吡啶基	H
3-331	Ph	Me	Ph	H
3-332	Ph	Me	4-Cl-Ph	H
3-333	Ph	Me	2-噻吩基	H
3-334	Ph	Me	2-吡啶基	H
3-335	2-氟乙基	Me	Ph	H
3-336	2-氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-337	2-氟乙基	Me	2-噻吩基	H
3-338	2-氟乙基	Me	2-吡啶基	H
3-339	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-340	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-341	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-噻吩基	H
3-342	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-吡啶基	H
3-343	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-基甲基	Me	Ph	H
3-344	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-345	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-基甲基	Me	2-噻吩基	H
3-346	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-基甲基	Me	2-吡啶基	H
3-347	Et	Me	異喹啉-3-基	H
3-348	Et	Me	喹啉-2-基	H
3-349	丙-2-炔-1-基	Me	異喹啉-3-基	H
3-350	丙-2-炔-1-基	Me	喹啉-2-基	H
3-351	丁-2-炔-1-基	Me	異喹啉-3-基	H
3-352	丁-2-炔-1-基	Me	喹啉-2-基	H
3-353	2,2-二氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-354	丁-3-炔-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-355	丁-3-炔-2-基	Me	異喹啉-3-基	H
3-356	丁-3-炔-2-基	Me	喹啉-2-基	H
3-357	丁-3-炔-2-基	Me	Ph	H
3-358	丁-3-炔-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-359	丁-3-炔-2-基	Me	2-噻吩基	H
3-360	丁-3-炔-2-基	Me	3-吡啶基	H
3-361	丁-3-炔-2-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
3-362	丁-3-炔-2-基	Me	4-Me-Ph	H
3-363	丁-3-炔-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-364	丁-3-炔-2-基	Me	4-F-Ph	H
3-365	丁-3-炔-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-366	丁-3-炔-2-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
3-367	丁-3-炔-2-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-368	丁-3-炔-2-基	Me	2-吡啶基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-369	丁-3-炔-2-基	Me	4-吡啶基	H
3-370	Pr	Me	異喹啉-3-基	H
3-371	Pr	Me	喹啉-2-基	H
3-372	iPr	Me	異喹啉-3-基	H
3-373	iPr	Me	喹啉-2-基	H
3-374	CH <sub>2</sub> Ph	Me	異喹啉-3-基	H
3-375	CH <sub>2</sub> Ph	Me	喹啉-2-基	H
3-376	環丙基甲基	Me	異喹啉-3-基	H
3-377	環丙基甲基	Me	喹啉-2-基	H
3-378	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	異喹啉-3-基	H
3-379	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	喹啉-2-基	H
3-380	(1-甲基環丙基)甲基	Me	異喹啉-3-基	H
3-381	(1-甲基環丙基)甲基	Me	喹啉-2-基	H
3-382	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	異喹啉-3-基	H
3-383	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	喹啉-2-基	H
3-384	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	異喹啉-3-基	H
3-385	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	喹啉-2-基	H
3-386	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	異喹啉-3-基	H
3-387	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	喹啉-2-基	H
3-388	1-環丙基乙基	Me	異喹啉-3-基	H
3-389	1-環丙基乙基	Me	喹啉-2-基	H
3-390	烯丙基	Me	異喹啉-3-基	H
3-391	烯丙基	Me	喹啉-2-基	H
3-392	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	異喹啉-3-基	H
3-393	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	喹啉-2-基	H
3-394	環丁基甲基	Me	異喹啉-3-基	H
3-395	環丁基甲基	Me	喹啉-2-基	H
3-396	環戊基甲基	Me	異喹啉-3-基	H
3-397	環戊基甲基	Me	喹啉-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-398	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	異喹啉-3-基	H
3-399	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	喹啉-2-基	H
3-400	四氫呋喃-2-基甲基	Me	異喹啉-3-基	H
3-401	四氫呋喃-2-基甲基	Me	喹啉-2-基	H
3-402	四氫呋喃-2-基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-403	四氫呋喃-2-基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-404	氧雜環丁烷-3-基	Me	異喹啉-3-基	H
3-405	氧雜環丁烷-3-基	Me	喹啉-2-基	H
3-406	氧雜環丁烷-3-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-407	氧雜環丁烷-3-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-408	氧雜環丁烷-3-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
3-409	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	異喹啉-3-基	H
3-410	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	喹啉-2-基	H
3-411	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-412	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-413	2,2,2-三氟乙基	Me	異喹啉-3-基	H
3-414	2,2,2-三氟乙基	Me	喹啉-2-基	H
3-415	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-416	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-417	2,2-二氟乙基	Me	異喹啉-3-基	H
3-418	2,2-二氟乙基	Me	喹啉-2-基	H
3-419	2,2-二氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-420	2,2-二氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-421	Et	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-422	Et	Me	5-I-嘧啶-2-基	H
3-423	Et	Cl	4-F-Ph	H
3-424	Et	Cl	3-吡啶基	H
3-425	Et	Cl	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-426	Et	Cl	5-Br-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-427	Et	Cl	5-F-吡啶-2-基	H
3-428	Et	Cl	5-I-吡啶-2-基	H
3-429	Et	Cl	5-Me-吡啶-2-基	H
3-430	Et	Cl	6-Me-吡啶-3-基	H
3-431	Et	Cl	4-Me-吡啶-2-基	H
3-432	Et	Cl	4-F-吡啶-2-基	H
3-433	Et	Cl	4-Cl-吡啶-2-基	H
3-434	Et	Cl	4-Br-吡啶-2-基	H
3-435	Et	Cl	4-OMe-吡啶-2-基	H
3-436	Et	Cl	2-嘧啶基	H
3-437	Et	Cl	5-F-嘧啶-2-基	H
3-438	Et	Cl	5-Cl-嘧啶-2-基	H
3-439	Et	Cl	5-Br-嘧啶-2-基	H
3-440	Et	Cl	5-I-嘧啶-2-基	H
3-441	Et	Cl	5-Me-嘧啶-2-基	H
3-442	Et	Cl	5-Me-吡嗪-2-基	H
3-443	Et	Cl	2-吡嗪基	H
3-444	Et	Cl	異喹啉-3-基	H
3-445	Et	Cl	喹啉-2-基	H
3-446	Et	Cl	1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-447	Et	Cl	7-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-448	Et	Cl	2-噁唑基	H
3-449	Et	Cl	5-Br-噁唑-2-基	H
3-450	Et	Cl	5-Me-噁唑-2-基	H
3-451	Et	Cl	5-Cl-噁唑-2-基	H
3-452	Et	Cl	2-噁吩基	H
3-453	Et	Cl	3-Me-2-噁吩基	H
3-454	Et	Cl	4-Me-2-噁吩基	H
3-455	Et	Cl	5-Br-2-噁吩基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-456	Et	Cl	5-Cl-2-噻吩基	H
3-457	Et	Me	3-Br-Ph	H
3-458	Et	Me	4-噻唑基	H
3-459	環丙基甲基	Me	4-噻唑基	H
3-460	丙-2-炔-1-基	Me	4-噻唑基	H
3-461	丁-2-炔-1-基	Me	4-噻唑基	H
3-462	丁-3-炔-2-基	Me	4-噻唑基	H
3-463	Pr	Me	4-噻唑基	H
3-464	iPr	Me	4-噻唑基	H
3-465	CH <sub>2</sub> Ph	Me	4-噻唑基	H
3-466	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	4-噻唑基	H
3-467	(1-甲基環丙基)甲基	Me	4-噻唑基	H
3-468	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	4-噻唑基	H
3-469	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	4-噻唑基	H
3-470	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	4-噻唑基	H
3-471	1-環丙基乙基	Me	4-噻唑基	H
3-472	烯丙基	Me	4-噻唑基	H
3-473	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-噻唑基	H
3-474	環丁基甲基	Me	4-噻唑基	H
3-475	環戊基甲基	Me	4-噻唑基	H
3-476	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-噻唑基	H
3-477	四氫呋喃-2-基甲基	Me	4-噻唑基	H
3-478	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	4-噻唑基	H
3-479	2,2,2-三氟乙基	Me	4-噻唑基	H
3-480	2,2-二氟乙基	Me	4-噻唑基	H
3-481	氧雜環丁烷-3-基	Me	4-噻唑基	H
3-482	環丙基甲基	Me	3-Br-Ph	H
3-483	丙-2-炔-1-基	Me	3-Br-Ph	H
3-484	丁-2-炔-1-基	Me	3-Br-Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-485	丁-3-炔-2-基	Me	3-Br-Ph	H
3-486	Pr	Me	3-Br-Ph	H
3-487	iPr	Me	3-Br-Ph	H
3-488	CH <sub>2</sub> Ph	Me	3-Br-Ph	H
3-489	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	3-Br-Ph	H
3-490	(1-甲基環丙基)甲基	Me	3-Br-Ph	H
3-491	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	3-Br-Ph	H
3-492	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	3-Br-Ph	H
3-493	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	3-Br-Ph	H
3-494	1-環丙基乙基	Me	3-Br-Ph	H
3-495	烯丙基	Me	3-Br-Ph	H
3-496	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	3-Br-Ph	H
3-497	環丁基甲基	Me	3-Br-Ph	H
3-498	環戊基甲基	Me	3-Br-Ph	H
3-499	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	3-Br-Ph	H
3-500	四氫呋喃-2-基甲基	Me	3-Br-Ph	H
3-501	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	3-Br-Ph	H
3-502	2,2,2-三氟乙基	Me	3-Br-Ph	H
3-503	2,2-二氟乙基	Me	3-Br-Ph	H
3-504	氧雜環丁烷-3-基	Me	3-Br-Ph	H
3-505	Et	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-506	環丙基甲基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-507	丙-2-炔-1-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-508	丁-2-炔-1-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-509	丁-3-炔-2-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-510	Pr	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-511	iPr	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-512	CH <sub>2</sub> Ph	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-513	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-514	(1-甲基環丙基)甲基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-515	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-516	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-517	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-518	1-環丙基乙基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-519	烯丙基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-520	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-521	環丁基甲基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-522	環戊基甲基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-523	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-524	四氫呋喃-2-基甲基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-525	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-526	2,2,2-三氟乙基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-527	2,2-二氟乙基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-528	氧雜環丁烷-3-基	Me	2-Cl-噻唑-4-基	H
3-529	Et	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-530	環丙基甲基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-531	丙-2-炔-1-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-532	丁-2-炔-1-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-533	丁-3-炔-2-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-534	Pr	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-535	iPr	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-536	CH <sub>2</sub> Ph	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-537	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-538	(1-甲基環丙基)甲基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-539	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-540	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-541	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-542	1-環丙基乙基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-543	烯丙基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-544	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-545	環丁基甲基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-546	環戊基甲基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-547	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-548	四氫呋喃-2-基甲基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-549	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-550	2,2,2-三氟乙基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-551	2,2-二氟乙基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-552	氧雜環丁烷-3-基	Me	2-Br-噻唑-4-基	H
3-553	環丙基甲基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-554	丙-2-炔-1-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-555	丁-2-炔-1-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-556	丁-3-炔-2-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-557	Pr	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-558	iPr	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-559	CH <sub>2</sub> Ph	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-560	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-561	(1-甲基環丙基)甲基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-562	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-563	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-564	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-565	1-環丙基乙基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-566	烯丙基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-567	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-568	環丁基甲基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-569	環戊基甲基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-570	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-571	四氫呋喃-2-基甲基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-572	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-573	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-574	2,2-二氟乙基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-575	氧雜環丁烷-3-基	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
3-576	環丙基甲基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-577	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-578	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-579	丁-3-炔-2-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-580	Pr	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-581	iPr	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-582	CH <sub>2</sub> Ph	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-583	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-584	(1-甲基環丙基)甲基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-585	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-586	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-587	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-588	1-環丙基乙基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-589	烯丙基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-590	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-591	環丁基甲基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-592	環戊基甲基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-593	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-594	四氫呋喃-2-基甲基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-595	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-596	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-597	2,2-二氟乙基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-598	氧雜環丁烷-3-基	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
3-599	Et	Me	5-OSO <sub>2</sub> Me-吡啶-2-基	H
3-600	環丙基甲基	Me	5-OSO <sub>2</sub> Me-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-601	丙-2-炔-1-基	Me	5-OSO <sub>2</sub> Me-吡啶-2-基	H
3-602	丁-3-炔-2-基	Me	5-OSO <sub>2</sub> Me-吡啶-2-基	H
3-603	iPr	Me	5-OSO <sub>2</sub> Me-吡啶-2-基	H
3-604	CH <sub>2</sub> Ph	Me	5-OSO <sub>2</sub> Me-吡啶-2-基	H
3-605	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	5-OSO <sub>2</sub> Me-吡啶-2-基	H
3-606	烯丙基	Me	5-OSO <sub>2</sub> Me-吡啶-2-基	H
3-607	2,2,2-三氟乙基	Me	5-OSO <sub>2</sub> Me-吡啶-2-基	H
3-608	2,2-二氟乙基	Me	5-OSO <sub>2</sub> Me-吡啶-2-基	H
3-609	氧雜環丁烷-3-基	Me	5-OSO <sub>2</sub> Me-吡啶-2-基	H
3-610	Et	Me	6-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-611	環丙基甲基	Me	6-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-612	丙-2-炔-1-基	Me	6-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-613	丁-3-炔-2-基	Me	6-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-614	iPr	Me	6-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-615	CH <sub>2</sub> Ph	Me	6-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-616	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	6-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-617	烯丙基	Me	6-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-618	2,2,2-三氟乙基	Me	6-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-619	2,2-二氟乙基	Me	6-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-620	氧雜環丁烷-3-基	Me	6-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-621	Et	Me	6-Br-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-622	環丙基甲基	Me	6-Br-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-623	丙-2-炔-1-基	Me	6-Br-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-624	丁-3-炔-2-基	Me	6-Br-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-625	iPr	Me	6-Br-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-626	CH <sub>2</sub> Ph	Me	6-Br-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-627	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	6-Br-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-628	烯丙基	Me	6-Br-1,3-苯並噻唑-2-基	H
3-629	2,2,2-三氟乙基	Me	6-Br-1,3-苯並噻唑-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-630	2,2-二氟乙基	Me	6-Br-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-631	氧雜環丁烷-3-基	Me	6-Br-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-632	Et	Me	1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-633	環丙基甲基	Me	1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-634	丙-2-炔-1-基	Me	1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-635	丁-3-炔-2-基	Me	1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-636	iPr	Me	1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-637	CH <sub>2</sub> Ph	Me	1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-638	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-639	烯丙基	Me	1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-640	2,2,2-三氟乙基	Me	1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-641	2,2-二氟乙基	Me	1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-642	氧雜環丁烷-3-基	Me	1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-643	Et	Me	6-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-644	環丙基甲基	Me	6-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-645	丙-2-炔-1-基	Me	6-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-646	丁-3-炔-2-基	Me	6-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-647	iPr	Me	6-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-648	CH <sub>2</sub> Ph	Me	6-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-649	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	6-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-650	烯丙基	Me	6-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-651	2,2,2-三氟乙基	Me	6-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-652	2,2-二氟乙基	Me	6-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-653	氧雜環丁烷-3-基	Me	6-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-654	Et	Me	6-Br-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-655	環丙基甲基	Me	6-Br-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-656	丙-2-炔-1-基	Me	6-Br-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-657	丁-3-炔-2-基	Me	6-Br-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-658	iPr	Me	6-Br-1,3-苯並噁唑-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-659	CH <sub>2</sub> Ph	Me	6-Br-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-660	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	6-Br-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-661	烯丙基	Me	6-Br-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-662	2,2,2-三氟乙基	Me	6-Br-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-663	2,2-二氟乙基	Me	6-Br-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-664	氧雜環丁烷-3-基	Me	6-Br-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-665	Et	Me	7-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-666	環丙基甲基	Me	7-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-667	丙-2-炔-1-基	Me	7-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-668	丁-3-炔-2-基	Me	7-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-669	iPr	Me	7-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-670	CH <sub>2</sub> Ph	Me	7-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-671	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	7-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-672	烯丙基	Me	7-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-673	2,2,2-三氟乙基	Me	7-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-674	2,2-二氟乙基	Me	7-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-675	氧雜環丁烷-3-基	Me	7-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基	H
3-676	環丙基甲基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-677	丙-2-炔-1-基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-678	丁-3-炔-2-基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-679	iPr	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-680	CH <sub>2</sub> Ph	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-681	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-682	烯丙基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-683	2,2,2-三氟乙基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-684	2,2-二氟乙基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-685	氧雜環丁烷-3-基	Me	5-I-吡啶-2-基	H
3-686	Et	Me	5-NH <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-687	環丙基甲基	Me	5-NH <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-688	丙-2-炔-1-基	Me	5-NH <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-689	CH <sub>2</sub> Ph	Me	5-NH <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-690	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	5-NH <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-691	2,2,2-三氟乙基	Me	5-NH <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-692	2,2-二氟乙基	Me	5-NH <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-693	氧雜環丁烷-3-基	Me	5-NH <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-694	Et	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
3-695	環丙基甲基	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
3-696	丙-2-炔-1-基	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
3-697	CH <sub>2</sub> Ph	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
3-698	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
3-699	2,2,2-三氟乙基	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
3-700	2,2-二氟乙基	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
3-701	氧雜環丁烷-3-基	Me	5-OH-吡啶-2-基	H
3-702	Et	Me	5-OCHF <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-703	環丙基甲基	Me	5-OCHF <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-704	丙-2-炔-1-基	Me	5-OCHF <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-705	CH <sub>2</sub> Ph	Me	5-OCHF <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-706	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	5-OCHF <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-707	2,2,2-三氟乙基	Me	5-OCHF <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-708	2,2-二氟乙基	Me	5-OCHF <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-709	氧雜環丁烷-3-基	Me	5-OCHF <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-710	Et	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
3-711	環丙基甲基	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
3-712	丙-2-炔-1-基	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
3-713	CH <sub>2</sub> Ph	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
3-714	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
3-715	2,2,2-三氟乙基	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
3-716	2,2-二氟乙基	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-717	氧雜環丁烷-3-基	Me	5-MeO-吡啶-2-基	H
3-718	Et	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-719	環丙基甲基	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-720	丙-2-炔-1-基	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-721	CH <sub>2</sub> Ph	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-722	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-723	2,2,2-三氟乙基	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-724	2,2-二氟乙基	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-725	氧雜環丁烷-3-基	Me	5-MeS-吡啶-2-基	H
3-726	Et	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
3-727	環丙基甲基	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
3-728	丙-2-炔-1-基	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
3-729	CH <sub>2</sub> Ph	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
3-730	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
3-731	2,2,2-三氟乙基	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
3-732	2,2-二氟乙基	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
3-733	氧雜環丁烷-3-基	Me	5-NHMe-吡啶-2-基	H
3-734	Et	Me	5-NMe <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-735	環丙基甲基	Me	5-NMe <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-736	丙-2-炔-1-基	Me	5-NMe <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-737	CH <sub>2</sub> Ph	Me	5-NMe <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-738	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	5-NMe <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-739	2,2,2-三氟乙基	Me	5-NMe <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-740	2,2-二氟乙基	Me	5-NMe <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-741	氧雜環丁烷-3-基	Me	5-NMe <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
3-742	3-羥基丁-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-743	3-羥基丁-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-744	3-羥基丁-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-745	3-羥基丁-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-746	3-羥基丁-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-747	3-羥基丁-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-748	3-乙基戊-1-炔-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-749	3-乙基戊-1-炔-3-基	Me	4-Br-Ph	H
3-750	3-乙基戊-1-炔-3-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-751	3-乙基戊-1-炔-3-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-752	3-乙基戊-1-炔-3-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-753	3-乙基戊-1-炔-3-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-754	二氟甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-755	二氟甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-756	二氟甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-757	二氟甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-758	二氟甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-759	二氟甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-760	2,2,3,3-四氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-761	2,2,3,3-四氟丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-762	2,2,3,3-四氟丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-763	2,2,3,3-四氟丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-764	2,2,3,3-四氟丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-765	2,2,3,3-四氟丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-766	4,4,4-三氟丁基	Me	4-Cl-Ph	H
3-767	4,4,4-三氟丁基	Me	4-Br-Ph	H
3-768	4,4,4-三氟丁基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-769	4,4,4-三氟丁基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-770	4,4,4-三氟丁基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-771	4,4,4-三氟丁基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-772	乙醯氧基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-773	乙醯氧基甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-774	乙醯氧基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-775	乙醯氧基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-776	乙醯氧基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-777	乙醯氧基甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-778	2-氯乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-779	2-氯乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-780	2-氯乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-781	2-氯乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-782	2-氯乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-783	2-氯乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-784	3-氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-785	3-氟丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-786	3-氟丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-787	3-氟丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-788	3-氟丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-789	3-氟丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-790	2-乙氧基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-791	2-乙氧基乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-792	2-乙氧基乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-793	2-乙氧基乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-794	2-乙氧基乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-795	2-乙氧基乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-796	2-丙-1-醇	Me	4-Cl-Ph	H
3-797	2-丙-1-醇	Me	4-Br-Ph	H
3-798	1-羥基丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-799	1-羥基丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-800	1-羥基丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-801	1-羥基丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-802	2-甲氧基丁-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-803	2-甲氧基丁-1-基	Me	4-Br-Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-804	2-甲氧基丁-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-805	2-甲氧基丁-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-806	2-甲氧基丁-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-807	2-甲氧基丁-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-808	1,3-二氟丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-809	1,3-二氟丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-810	1,3-二氟丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-811	1,3-二氟丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-812	1,3-二氟丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-813	1,3-二氟丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-814	2,3-二甲氧基丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-815	2,3-二甲氧基丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-816	2,3-二甲氧基丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-817	2,3-二甲氧基丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-818	2,3-二甲氧基丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-819	2,3-二甲氧基丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-820	1,3-二噁茂烷-4-基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-821	1,3-二噁茂烷-4-基甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-822	1,3-二噁茂烷-4-基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-823	1,3-二噁茂烷-4-基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-824	1,3-二噁茂烷-4-基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-825	1,3-二噁茂烷-4-基甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-826	1,1,1,4,4,4-六氟丁-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-827	1,1,1,4,4,4-六氟丁-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-828	1,1,1,4,4,4-六氟丁-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-829	1,1,1,4,4,4-六氟丁-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-830	1,1,1,4,4,4-六氟丁-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-831	1,1,1,4,4,4-六氟丁-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-832	1,1-二氟丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-833	1,1-二氟丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-834	1,1-二氟丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-835	1,1-二氟丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-836	1,1-二氟丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-837	1,1-二氟丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-838	1-氟丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-839	1-氟丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-840	1-氟丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-841	1-氟丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-842	1-氟丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-843	1-氟丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-844	1-溴丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-845	1-溴丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-846	1-溴丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-847	1-溴丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-848	1-溴丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-849	1-溴丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-850	1-氯丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-851	1-氯丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-852	1-氯丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-853	1-氯丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-854	1-氯丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-855	1-氯丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-856	2-異丙氧基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-857	2-異丙氧基乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-858	2-異丙氧基乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-859	2-異丙氧基乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-860	2-異丙氧基乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-861	2-異丙氧基乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-862	四氫呋喃-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-863	四氫呋喃-3-基	Me	4-Br-Ph	H
3-864	四氫呋喃-3-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-865	四氫呋喃-3-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-866	四氫呋喃-3-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-867	四氫呋喃-3-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-868	2-(2,2,2-三氟乙氧基)乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-869	2-(2,2,2-三氟乙氧基)乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-870	2-(2,2,2-三氟乙氧基)乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-871	2-(2,2,2-三氟乙氧基)乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-872	2-(2,2,2-三氟乙氧基)乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-873	2-(2,2,2-三氟乙氧基)乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-874	(3,3,4,4,4-五氟丁-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-875	(3,3,4,4,4-五氟丁-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-876	(3,3,4,4,4-五氟丁-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-877	(3,3,4,4,4-五氟丁-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-878	(3,3,4,4,4-五氟丁-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-879	(3,3,4,4,4-五氟丁-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-880	1-(N,N-二甲基胺基羰基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-881	1-(N,N-二甲基胺基羰基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-882	1-(N,N-二甲基胺基羰基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-883	1-(N,N-二甲基胺基羰基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-884	1-(N,N-二甲基胺基羰基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-885	1-(N,N-二甲基胺基羰基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-886	(1,3-二噁烷-2-基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-887	(1,3-二噁烷-2-基)甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-888	(1,3-二噁烷-2-基)甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-889	(1,3-二噁烷-2-基)甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-890	(1,3-二噁烷-2-基)甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-891	(1,3-二噁烷-2-基)甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-892	1,1,1-三氟丁-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-893	1,1,1-三氟丁-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-894	1,1,1-三氟丁-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-895	1,1,1-三氟丁-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-896	1,1,1-三氟丁-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-897	1,1,1-三氟丁-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-898	2-(丁-2-亞基胺基氧基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-899	2-(丁-2-亞基胺基氧基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-900	2-(丁-2-亞基胺基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-901	2-(丁-2-亞基胺基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-902	2-(丁-2-亞基胺基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-903	2-(丁-2-亞基胺基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-904	氧雜環丁烷-2-基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-905	氧雜環丁烷-2-基甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-906	氧雜環丁烷-2-基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-907	氧雜環丁烷-2-基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-908	氧雜環丁烷-2-基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-909	氧雜環丁烷-2-基甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-910	2,2-二甲氧基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-911	2,2-二甲氧基乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-912	2,2-二甲氧基乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-913	2,2-二甲氧基乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-914	2,2-二甲氧基乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-915	2,2-二甲氧基乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-916	1-氯丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-917	1-氯丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-918	1-氯丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-919	1-氯丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-920	1-氯丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-921	1-氯丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-922	4-氯丁-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-923	4-氯丁-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-924	4-氯丁-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-925	4-氯丁-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-926	4-氯丁-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-927	4-氯丁-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-928	3-氯丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-929	3-氯丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-930	3-氯丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-931	3-氯丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-932	3-氯丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-933	3-氯丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-934	2-(2-氯乙氧基)乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-935	2-(2-氯乙氧基)乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-936	2-(2-氯乙氧基)乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-937	2-(2-氯乙氧基)乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-938	2-(2-氯乙氧基)乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-939	2-(2-氯乙氧基)乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-940	2,2-二氯乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-941	2,2-二氯乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-942	2,2-二氯乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-943	2,2-二氯乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-944	2,2-二氯乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-945	2,2-二氯乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-946	2,3-二氯丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-947	2,3-二氯丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-948	2,3-二氯丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-949	2,3-二氯丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-950	2,3-二氯丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-951	2,3-二氯丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-952	1,3-二氯丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-953	1,3-二氯丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-954	1,3-二氯丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-955	1,3-二氯丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-956	1,3-二氯丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-957	1,3-二氯丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-958	2-氯-2,2-二氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-959	2-氯-2,2-二氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-960	2-氯-2,2-二氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-961	2-氯-2,2-二氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-962	2-氯-2,2-二氟乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-963	2-氯-2,2-二氟乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-964	1-氯-2-甲基丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-965	1-氯-2-甲基丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-966	1-氯-2-甲基丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-967	1-氯-2-甲基丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-968	1-氯-2-甲基丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-969	1-氯-2-甲基丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-970	1-氟-3-甲氧基丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-971	1-氟-3-甲氧基丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-972	1-氟-3-甲氧基丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-973	1-氟-3-甲氧基丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-974	1-氟-3-甲氧基丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-975	1-氟-3-甲氧基丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-976	3,3,3-三氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-977	3,3,3-三氟丙基	Me	4-Br-Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-978	3,3,3-三氟丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-979	3,3,3-三氟丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-980	3,3,3-三氟丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-981	3,3,3-三氟丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-982	2-氯苯基	Me	4-Cl-Ph	H
3-983	2-氯苯基	Me	4-Br-Ph	H
3-984	2-氯苯基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-985	2-氯苯基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-986	2-氯苯基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-987	2-氯苯基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-988	2-氯吡啶-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-989	2-氯吡啶-3-基	Me	4-Br-Ph	H
3-990	2-氯吡啶-3-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-991	2-氯吡啶-3-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-992	2-氯吡啶-3-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-993	2-氯吡啶-3-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-994	3-氯吡啶-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-995	3-氯吡啶-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-996	3-氯吡啶-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-997	3-氯吡啶-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-998	3-氯吡啶-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-999	3-氯吡啶-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1000	五氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1001	五氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1002	五氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1003	五氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1004	五氟乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1005	五氟乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1006	1,2,2,2-四氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-1007	1,2,2,2-四氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1008	1,2,2,2-四氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1009	1,2,2,2-四氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1010	1,2,2,2-四氟乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1011	1,2,2,2-四氟乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1012	1,1,2,2-四氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1013	1,1,2,2-四氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1014	1,1,2,2-四氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1015	1,1,2,2-四氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1016	1,1,2,2-四氟乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1017	1,1,2,2-四氟乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1018	1,1,2-三氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1019	1,1,2-三氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1020	1,1,2-三氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1021	1,1,2-三氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1022	1,1,2-三氟乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1023	1,1,2-三氟乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1024	2-甲基丁-3-炔-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1025	2-甲基丁-3-炔-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1026	2-甲基丁-3-炔-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1027	2-甲基丁-3-炔-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1028	2-甲基丁-3-炔-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1029	2-甲基丁-3-炔-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1030	1-(乙氧羰基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1031	1-(乙氧羰基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1032	1-(乙氧羰基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1033	1-(乙氧羰基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1034	1-(乙氧羰基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1035	1-(乙氧羰基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-1036	1,1,2,3,3,3-六氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1037	1,1,2,3,3,3-六氟丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1038	1,1,2,3,3,3-六氟丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1039	1,1,2,3,3,3-六氟丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1040	1,1,2,3,3,3-六氟丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1041	1,1,2,3,3,3-六氟丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1042	異丁基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1043	異丁基	Me	4-Br-Ph	H
3-1044	異丁基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1045	異丁基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1046	異丁基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1047	異丁基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1048	正戊基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1049	正戊基	Me	4-Br-Ph	H
3-1050	正戊基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1051	正戊基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1052	正戊基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1053	正戊基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1054	正庚基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1055	正庚基	Me	4-Br-Ph	H
3-1056	正庚基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1057	正庚基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1058	正庚基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1059	正庚基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1060	正壬基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1061	正壬基	Me	4-Br-Ph	H
3-1062	正壬基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1063	正壬基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1064	正壬基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-1065	正壬基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1066	環戊基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1067	環戊基	Me	4-Br-Ph	H
3-1068	環戊基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1069	環戊基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1070	環戊基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1071	環戊基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1072	環己基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1073	環己基	Me	4-Br-Ph	H
3-1074	環己基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1075	環己基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1076	環己基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1077	環己基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1078	sBu	Me	4-Cl-Ph	H
3-1079	sBu	Me	4-Br-Ph	H
3-1080	sBu	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1081	sBu	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1082	sBu	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1083	sBu	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1084	戊-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1085	戊-3-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1086	戊-3-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1087	戊-3-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1088	戊-3-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1089	戊-3-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1090	1-(甲氧羰基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1091	1-(甲氧羰基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1092	1-(甲氧羰基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1093	1-(甲氧羰基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-1094	1-(甲氧羰基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1095	1-(甲氧羰基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1096	2,2,2-三氯乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1097	2,2,2-三氯乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1098	2,2,2-三氯乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1099	2,2,2-三氯乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1100	2,2,2-三氯乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1101	2,2,2-三氯乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1102	3-氯丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1103	3-氯丙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1104	3-氯丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1105	3-氯丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1106	3-氯丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1107	3-氯丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1108	2-(2-甲氧基乙氧基)乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1109	2-(2-甲氧基乙氧基)乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1110	2-(2-甲氧基乙氧基)乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1111	2-(2-甲氧基乙氧基)乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1112	2-(2-甲氧基乙氧基)乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1113	2-(2-甲氧基乙氧基)乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1114	丁基-2-基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1115	丁基-2-基甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1116	丁基-2-基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1117	丁基-2-基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1118	丁基-2-基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1119	丁基-2-基甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1120	丁-3-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1121	丁-3-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1122	丁-3-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-1123	丁-3-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1124	丁-3-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1125	丁-3-炔-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1126	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1127	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1128	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1129	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1130	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1131	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1132	2-(N,N-二乙基胺基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1133	2-(N,N-二乙基胺基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1134	2-(N,N-二乙基胺基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1135	2-(N,N-二乙基胺基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1136	2-(N,N-二乙基胺基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1137	2-(N,N-二乙基胺基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1138	2-羧基苯基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1139	2-羧基苯基	Me	4-Br-Ph	H
3-1140	2-羧基苯基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1141	2-羧基苯基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1142	2-羧基苯基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1143	2-羧基苯基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1144	第三丁基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1145	tBu	Me	4-Br-Ph	H
3-1146	tBu	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1147	tBu	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1148	tBu	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1149	tBu	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1150	1-甲基環丙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1151	1-甲基環丙基	Me	4-Br-Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-1152	1-甲基環丙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1153	1-甲基環丙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1154	1-甲基環丙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1155	1-甲基環丙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1156	三甲基甲矽烷基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1157	三甲基甲矽烷基甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1158	三甲基甲矽烷基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1159	三甲基甲矽烷基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1160	三甲基甲矽烷基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1161	三甲基甲矽烷基甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1162	2,3-二氫-1H-茚-5-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1163	2,3-二氫-1H-茚-5-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1164	2,3-二氫-1H-茚-5-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1165	2,3-二氫-1H-茚-5-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1166	2,3-二氫-1H-茚-5-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1167	2,3-二氫-1H-茚-5-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1168	1-甲基環丁基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1169	1-甲基環丁基	Me	4-Br-Ph	H
3-1170	1-甲基環丁基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1171	1-甲基環丁基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1172	1-甲基環丁基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1173	1-甲基環丁基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1174	2-(氧雜環丁烷-3-基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1175	2-(氧雜環丁烷-3-基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1176	2-(氧雜環丁烷-3-基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1177	2-(氧雜環丁烷-3-基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1178	2-(氧雜環丁烷-3-基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1179	2-(氧雜環丁烷-3-基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1180	Bu	Me	4-Cl-Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-1181	Bu	Me	4-Br-Ph	H
3-1182	Bu	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1183	Bu	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1184	Bu	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1185	Bu	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1186	2-(N,N-二乙基胺基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1187	2-(N,N-二乙基胺基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1188	2-(N,N-二乙基胺基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1189	2-(N,N-二乙基胺基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1190	2-(N,N-二乙基胺基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1191	2-(N,N-二乙基胺基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1192	2-(嗎啉-4-基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1193	2-(嗎啉-4-基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1194	2-(嗎啉-4-基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1195	2-(嗎啉-4-基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1196	2-(嗎啉-4-基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1197	2-(嗎啉-4-基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1198	2-氯噻吩-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1199	2-氯噻吩-3-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1200	2-氯噻吩-3-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1201	2-氯噻吩-3-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1202	2-氯噻吩-3-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1203	2-氯噻吩-3-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1204	(N,N-二甲基胺基羰基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1205	(N,N-二甲基胺基羰基)甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1206	(N,N-二甲基胺基羰基)甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1207	(N,N-二甲基胺基羰基)甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1208	(N,N-二甲基胺基羰基)甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1209	(N,N-二甲基胺基羰基)甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-1210	1-(t-丁基羰基氧基)-2-甲基丙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1211	1-(t-丁基羰基氧基)-2-甲基丙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1212	1-(t-丁基羰基氧基)-2-甲基丙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1213	1-(t-丁基羰基氧基)-2-甲基丙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1214	1-(t-丁基羰基氧基)-2-甲基丙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1215	1-(t-丁基羰基氧基)-2-甲基丙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1216	(5-甲基-2-酮-1,3-二噁茂-4-基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1217	(5-甲基-2-酮-1,3-二噁茂-4-基)甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1218	(5-甲基-2-酮-1,3-二噁茂-4-基)甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1219	(5-甲基-2-酮-1,3-二噁茂-4-基)甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1220	(5-甲基-2-酮-1,3-二噁茂-4-基)甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1221	(5-甲基-2-酮-1,3-二噁茂-4-基)甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1222	[(第三丁氧羰基)氧基]甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1223	[(第三丁氧羰基)氧基]甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1224	[(第三丁氧羰基)氧基]甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1225	[(第三丁氧羰基)氧基]甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1226	[(第三丁氧羰基)氧基]甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1227	[(第三丁氧羰基)氧基]甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1228	[(異丙氧羰基)氧基]甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1229	[(異丙氧羰基)氧基]甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1230	[(異丙氧羰基)氧基]甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1231	[(異丙氧羰基)氧基]甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1232	[(異丙氧羰基)氧基]甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1233	[(異丙氧羰基)氧基]甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1234	[(甲氧羰基)氧基]甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1235	[(甲氧羰基)氧基]甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1236	[(甲氧羰基)氧基]甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1237	[(甲氧羰基)氧基]甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1238	[(甲氧羰基)氧基]甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-1239	[(甲氧羰基)氧基]甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1240	1-[(乙氧羰基)氧基]乙基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1241	1-[(乙氧羰基)氧基]乙基	Me	4-Br-Ph	H
3-1242	1-[(乙氧羰基)氧基]乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1243	1-[(乙氧羰基)氧基]乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1244	1-[(乙氧羰基)氧基]乙基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1245	1-[(乙氧羰基)氧基]乙基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1246	1-乙醯氧基乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1247	1-乙醯氧基乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1248	1-乙醯氧基乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1249	1-乙醯氧基乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1250	1-乙醯氧基乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1251	1-乙醯氧基乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1252	1-(2-甲基丙醯基氧基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1253	1-(2-甲基丙醯基氧基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1254	1-(2-甲基丙醯基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1255	1-(2-甲基丙醯基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1256	1-(2-甲基丙醯基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1257	1-(2-甲基丙醯基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1258	1-丙醯基-2-甲基丙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1259	1-丙醯基-2-甲基丙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1260	1-丙醯基-2-甲基丙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1261	1-丙醯基-2-甲基丙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1262	1-丙醯基-2-甲基丙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1263	1-丙醯基-2-甲基丙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1264	1-(環己氧羰基氧基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1265	1-(環己氧羰基氧基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1266	1-(環己氧羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1267	1-(環己氧羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-1268	1-(環己氧羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1269	1-(環己氧羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1270	環丁基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1271	環丁基	Me	4-Br-Ph	H
3-1272	環丁基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1273	環丁基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1274	環丁基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1275	環丁基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1276	CH <sub>2</sub> (4-Me-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
3-1277	CH <sub>2</sub> (4-Me-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
3-1278	CH <sub>2</sub> (4-Me-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1279	CH <sub>2</sub> (4-Me-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1280	CH <sub>2</sub> (4-Me-Ph)	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1281	CH <sub>2</sub> (4-Me-Ph)	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1282	CHMe(4-Cl-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
3-1283	CHMe(4-Cl-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
3-1284	CHMe(4-Cl-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1285	CHMe(4-Cl-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1286	CHMe(4-Cl-Ph)	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1287	CHMe(4-Cl-Ph)	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1288	CHMePh	Me	4-Cl-Ph	H
3-1289	CHMePh	Me	4-Br-Ph	H
3-1290	CHMePh	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1291	CHMePh	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1292	CHMePh	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1293	CHMePh	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1294	1,1,1-三氟丙-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1295	1,1,1-三氟丙-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1296	1,1,1-三氟丙-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-1297	1,1,1-三氟丙-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1298	1,1,1-三氟丙-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1299	1,1,1-三氟丙-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1300	(1-乙基-3-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1301	(1-乙基-3-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1302	(1-乙基-3-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1303	(1-乙基-3-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1304	(1-乙基-3-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1305	(1-乙基-3-甲基-1H-吡啶-4-基)甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1306	Pr	Me	4-Cl-Ph	H
3-1307	Pr	Me	4-Br-Ph	H
3-1308	Pr	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1309	Pr	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1310	Pr	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1311	Pr	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1312	正十八烷基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1313	正十八烷基	Me	4-Br-Ph	H
3-1314	正十八烷基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1315	正十八烷基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1316	正十八烷基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1317	正十八烷基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1318	正十六烷基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1319	正十六烷基	Me	4-Br-Ph	H
3-1320	正十六烷基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1321	正十六烷基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1322	正十六烷基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1323	正十六烷基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1324	氧雜環丁烷-3-基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1325	氧雜環丁烷-3-基甲基	Me	4-Br-Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-1326	氧雜環丁烷-3-基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1327	氧雜環丁烷-3-基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1328	氧雜環丁烷-3-基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1329	氧雜環丁烷-3-基甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1330	3-甲基氧雜環丁烷-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1331	3-甲基氧雜環丁烷-3-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1332	3-甲基氧雜環丁烷-3-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1333	3-甲基氧雜環丁烷-3-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1334	3-甲基氧雜環丁烷-3-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1335	3-甲基氧雜環丁烷-3-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1336	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1337	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1338	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1339	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1340	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1341	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1342	(3E)-戊-3-烯-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1343	(3E)-戊-3-烯-2-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1344	(3E)-戊-3-烯-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1345	(3E)-戊-3-烯-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1346	(3E)-戊-3-烯-2-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1347	(3E)-戊-3-烯-2-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1348	(2,2-二甲基丙醯基氧基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
3-1349	(2,2-二甲基丙醯基氧基)甲基	Me	4-Br-Ph	H
3-1350	(2,2-二甲基丙醯基氧基)甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1351	(2,2-二甲基丙醯基氧基)甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1352	(2,2-二甲基丙醯基氧基)甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1353	(2,2-二甲基丙醯基氧基)甲基	Me	5-Br-2-噻吩基	H
3-1354	2-(異丙氧羰基氧基)乙-1-基	Me	4-Cl-Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
3-1355	2-(異丙氧羰基氧基)乙-1-基	Me	4-Br-Ph	H
3-1356	2-(異丙氧羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
3-1357	2-(異丙氧羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
3-1358	2-(異丙氧羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
3-1359	2-(異丙氧羰基氧基)乙-1-基	Me	5-Br-2-噻吩基	H

此外，測得本發明之通式(I)化合物的 NMR 數據。代表化合物的 NMR 分別以 400 MHz 之 <sup>1</sup>H-NMR 光譜的形式記錄(CDCl<sub>3</sub>) (<sup>1</sup>H 核磁共振數據)。部份例示化合物之特徵化學位移 δ (ppm)示於下文：

NMR 化合物 3-135 (CDCl<sub>3</sub> , 400 MHz , δ ppm) :

0.28 (*m* , 2H) ; 0.58 (*m* , 2H) ; 1.12 (*m* , 1H) ; 2.40 (*s* , 3H) ; 3.54 (*s* , 2H) ; 3.95 (*d* , 2H) ; 7.52 (*d* , 1H) ; 7.78 (*dd* , 1H) ; 8.52 (*d* , 1H) ; 8.65 (*s* , 2H) ; 9.09 (*s* , 1H) 。

NMR 化合物 3-353 (CDCl<sub>3</sub> , 400 MHz , δ ppm) :

2.38 (*s* , 3H) ; 3.62 (*s* , 2H) ; 4.32 (*txd* , 2H) ; 5.95 (*txt* , 1H) ; 7.33 (*d* , 1H) ; 7.75 (*dd* , 1H) ; 8.58 (*d* , 1H) ; 8.67 (*s* , 2H) ; 9.10 (*s* , 1H) 。

NMR 化合物 3-112 (CDCl<sub>3</sub> , 400 MHz , δ ppm) :

2.38 (*s* , 3H) ; 2.49 (*t* , 1H) ; 3.60 (*s* , 2H) ; 4.70 (*d* , 2H) ; 7.41 (*d* , 1H) ; 7.74 (*dd* , 1H) ; 8.54 (*d* , 1H) ; 8.65 (*s* ,

2H); 9.08 (*s*, 1H)。

NMR 化合物 3-25 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

1.26 (*t*, 3H); 2.38 (*s*, 3H); 3.52 (*s*, 2H); 4.16 (*q*, 2H)  
; 7.49 (*d*, 1H); 7.77 (*dd*, 1H); 8.53 (*d*, 1H); 8.65 (*s*,  
2H); 9.08 (*s*, 1H)。

NMR 化合物 3-26 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

1.28 (*t*, 3H); 2.38 (*s*, 3H); 3.51 (*s*, 2H); 4.17 (*q*, 2H)  
; 7.41 (*d*, 1H); 7.91 (*dd*, 1H); 8.63 (*d*, 1H); 8.64 (*s*,  
2H); 9.09 (*s*, 1H)。

NMR 化合物 3-136 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

0.28 (*m*, 2H); 0.58 (*m*, 2H); 1.12 (*m*, 1H); 2.40 (*s*,  
3H); 3.52 (*s*, 2H); 3.97 (*d*, 2H); 7.43 (*d*, 1H); 7.91  
(*dd*, 1H); 8.63 (*d*, 1H); 8.65 (*s*, 2H); 9.08 (*s*, 1H)。

NMR 化合物 3-176 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

1.82 (*s*, 3H); 2.38 (*s*, 3H); 3.59 (*s*, 2H); 4.22 (*s*, 2H)  
; 7.48 (*d*, 1H); 7.90 (*dd*, 1H); 8.64 (*d*, 1H); 8.65 (*s*,  
2H); 9.09 (*s*, 1H)。

NMR 化合物 3-161 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

1.85 (*s*, 3H); 2.38 (*s*, 3H); 3.42 (*s*, 2H); 4.22 (*s*, 2H)

; 7.21 (*d*, 2H); 7.40 (*d*, 2H); 8.62 (*s*, 2H); 9.04 (*s*, 1H)。

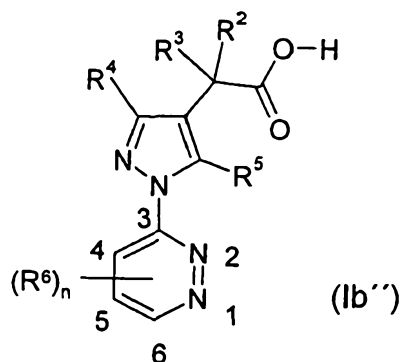
NMR 化合物 3-121 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

0.29 (*m*, 2H); 0.59 (*m*, 2H); 1.12 (*m*, 1H); 2.39 (*s*, 3H); 3.40 (*s*, 2H); 3.92 (*d*, 2H); 7.21 (*d*, 2H); 7.40 (*d*, 2H); 8.62 (*s*, 2H); 9.03 (*s*, 1H)。

NMR 化合物 3-4 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

1.27 (*t*, 3H); 2.38 (*s*, 3H); 3.38 (*s*, 2H); 4.17 (*q*, 2H); 7.20 (*d*, 2H); 7.40 (*d*, 2H); 8.62 (*s*, 2H); 9.03 (*s*, 1H)。

表 4： 式 (Ib'') 所示化合物



編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
4-1	H	H	Ph	Ph	H
4-2	H	H	Me	Ph	H
4-3	H	H	Me	5-I-2-噻吩基	H
4-4	H	H	Me	2-呋喃基	H
4-5	H	H	Me	Ph	6-OMe
4-6	Me	H	Me	Ph	4-Me
4-7	H	H	Me	Ph	6-Cl
4-8	H	H	Me	Ph	4-CF <sub>3</sub>
4-9	H	H	Me	Ph	6-CF <sub>3</sub>
4-10	H	H	Me	Ph	4-Me
4-11	H	H	Me	Ph	4,6-Me <sub>2</sub>
4-12	H	H	Me	Ph	4,6-Cl <sub>2</sub>
4-13	H	H	Me	4-MeO-Ph	4-Me
4-14	H	H	Me	4-MeO-Ph	H
4-15	Me	H	Me	Ph	H
4-16	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
4-17	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Cl
4-18	H	H	Me	4-Me-Ph	H
4-19	H	H	Me	3-Cl-Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
4-20	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H
4-21	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Me
4-22	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
4-23	H	H	Me	3-Cl-Ph	4-Me
4-24	H	H	Me	2-Cl-Ph	4-Me
4-25	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
4-26	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Me
4-27	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Me
4-28	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
4-29	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
4-30	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H
4-31	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Cl
4-32	H	H	Me	Ph	4-Cl
4-33	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
4-34	H	H	Me	4-tBu-Ph	4-Me
4-35	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	4-Me
4-36	H	H	Me	Ph	4-OMe
4-37	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-OMe
4-38	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
4-39	H	H	Me	4-F-Ph	4-Cl
4-40	H	H	Me	4-F-Ph	4-Me
4-41	H	H	Me	3-Me-Ph	4-Me
4-42	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	4-Me
4-43	H	H	Me	3-Br-Ph	4-Me
4-44	H	H	Me	4-Ph-Ph	4-Me
4-45	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	H
4-46	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	H
4-47	H	H	Me	Ph	4-SMe
4-48	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SMe

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
4-49	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H
4-50	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	H
4-51	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	4-Me
4-52	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	4-Me
4-53	H	H	Me	2-吡啶基	4-Cl
4-54	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-F
4-55	H	H	Me	2-噻吩基	4-Me
4-56	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	4-Me
4-57	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	4-Me
4-58	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Me
4-59	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Cl
4-60	H	H	Me	3-噻吩基	4-Me
4-61	H	H	Me	2-噻吩基	H
4-62	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	H
4-63	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	H
4-64	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
4-65	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基	H
4-66	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
4-67	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	H
4-68	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	4-Me
4-69	H	H	Me	3-噻吩基	H
4-70	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-S(O)Me
4-71	H	H	Me	4-Br-Ph	4-Me
4-72	H	H	Me	1,3-苯並二噁茂-5-基	4-Me
4-73	H	H	Me	4-I-Ph	4-Me
4-74	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
4-75	H	H	Me	4-PhO-Ph	4-Me
4-76	H	H	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
4-77	H	H	Me	Ph	4-S(O)Me

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
4-78	H	H	H	Ph	H
4-79	H	H	H	Ph	4-Me
4-80	H	H	Et	Ph	H
4-81	H	H	n-Pr	Ph	H
4-82	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	H
4-83	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	H
4-84	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	H
4-85	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	H
4-86	H	H	Cl	Ph	H
4-87	H	H	Et	Ph	4-Me
4-88	H	H	n-Pr	Ph	4-Me
4-89	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	4-Me
4-90	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	4-Me
4-91	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	4-Me
4-92	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	4-Me
4-93	H	H	Cl	Ph	4-Me
4-94	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
4-95	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
4-96	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Cl-Ph	H
4-97	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
4-98	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Cl-Ph	H
4-99	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
4-100	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
4-101	H	H	Et	4-Me-Ph	H
4-102	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H
4-103	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Me-Ph	H
4-104	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H
4-105	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Me-Ph	H
4-106	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
4-107	H	H	Cl	4-Me-Ph	H
4-108	H	H	Et	2-吡啶基	H
4-109	H	H	n-Pr	2-吡啶基	H
4-110	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	2-吡啶基	H
4-111	H	H	CHCl <sub>2</sub>	2-吡啶基	H
4-112	H	H	CH <sub>2</sub> F	2-吡啶基	H
4-113	H	H	CHF <sub>2</sub>	2-吡啶基	H
4-114	H	H	Cl	2-吡啶基	H
4-115	H	H	Me	2-吡啶基	H
4-116	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
4-117	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Cl
4-118	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Me
4-119	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
4-120	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Cl
4-121	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Me
4-122	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
4-123	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
4-124	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	4-Me
4-125	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
4-126	H	H	Me	4-CH <sub>2</sub> COOH-Ph	4-Me
4-127	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	4-Me
4-128	H	H	Me	4-Br-Ph	H
4-129	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	H
4-130	H	H	Me	3-Me-Ph	H
4-131	H	H	Me	4-F-Ph	H
4-132	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
4-133	H	H	Me	4-tBu-Ph	H
4-134	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
4-135	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	4-Me

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
4-136	H	H	Me	3-吡啶基	H
4-137	H	H	Me	4-吡啶基	H
4-138	H	H	C(O)OMe	Ph	H
4-139	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
4-140	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SO <sub>2</sub> Me
4-141	H	H	Me	3-吡啶基	4-Me
4-142	H	H	Me	2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
4-143	H	H	Me	2-吡啶基	4-Me
4-144	H	H	H	4-Cl-Ph	4-Me
4-145	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
4-146	H	H	Me	Ph	4-Me
4-147	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
4-148	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Me
4-149	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Cl
4-150	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-F
4-151	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H
4-152	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H
4-153	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
4-154	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
4-155	H	H	Me	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基	H
4-156	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
4-157	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
4-158	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
4-159	H	H	CN	4-Cl-Ph	4-Me
4-160	H	H	CN	4-Me-Ph	H
4-161	H	H	CN	4-Me-Ph	4-Me
4-162	H	H	CN	Ph	H
4-163	H	H	CN	Ph	4-Me
4-164	H	H	CN	2-吡啶基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
4-165	H	H	CN	3-吡啶基	H
4-166	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H
4-167	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H
4-168	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
4-169	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H
4-170	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
4-171	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
4-172	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
4-173	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
4-174	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
4-175	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
4-176	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	H
4-177	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	4-Me
4-178	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	H
4-179	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	4-Me
4-180	H	H	甲醯基	Ph	H
4-181	H	H	甲醯基	Ph	4-Me
4-182	H	H	甲醯基	2-吡啶基	H
4-183	H	H	甲醯基	3-吡啶基	H
4-184	H	H	甲醯基	5-Cl-吡啶-2-基	H
4-185	H	H	甲醯基	5-Br-吡啶-2-基	H
4-186	H	H	甲醯基	5-F-吡啶-2-基	H
4-187	H	H	甲醯基	5-Me-吡啶-2-基	H
4-188	H	H	甲醯基	6-Me-吡啶-3-基	H
4-189	H	H	甲醯基	4-Me-吡啶-2-基	H
4-190	H	H	甲醯基	4-F-吡啶-2-基	H
4-191	H	H	甲醯基	4-Cl-吡啶-2-基	H
4-192	H	H	甲醯基	4-Br-吡啶-2-基	H
4-193	H	H	甲醯基	4-OMe-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
4-194	H	H	CH <sub>2</sub> OH	5-Me-吡啶-2-基	H
4-195	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Cl-Ph	H
4-196	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-吡啶-2-基	H
4-197	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-Ph	H
4-198	H	H	CH <sub>2</sub> OH	Ph	H
4-199	H	H	CH <sub>2</sub> OH	2-吡啶基	H
4-200	H	H	Me	2-噻唑基	H
4-201	H	H	Me	2-噻唑基	4-Cl
4-202	H	H	Me	2-噻唑基	4-Me
4-203	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
4-204	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Cl
4-205	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Me
4-206	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
4-207	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
4-208	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	4-Me
4-209	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
4-210	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
4-211	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	4-Me
4-212	H	H	Me	2-吡啶基	4-F
4-213	H	H	Me	2-吡嗪基	H
4-214	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
4-215	H	H	Me	2-吡嗪基	4-Me
4-216	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	H
4-217	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	4-Me
4-218	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
4-219	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	H
4-220	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	4-Me
4-221	H	H	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
4-222	H	H	Me	4,5-Cl <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
4-223	H	H	Me	2-嘧啶基	H
4-224	H	H	Me	2-嘧啶基	4-Me
4-225	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
4-226	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
4-227	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
4-228	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
4-229	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	4-Me
4-230	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
4-231	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	4-Me
4-232	H	H	Me	3-噻嗪基	H
4-233	H	H	Me	6-Me-噻嗪-3-基	H
4-234	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基	H
4-235	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H
4-236	H	H	Me	2-吡啶基	6-OMe
4-237	H	H	Me	2-吡啶基	6-Cl
4-238	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
4-239	H	H	Me	異喹啉-3-基	H
4-240	H	H	Me	喹啉-2-基	H

此外，測得本發明之通式(I)化合物的 NMR 數據。代表化合物的 NMR 分別以 400 MHz 之 <sup>1</sup>H-NMR 光譜的形式記錄 (CDCl<sub>3</sub>) (<sup>1</sup>H 核磁共振數據)。部份例示化合物之特徵化學位移 δ (ppm) 示於下文：

NMR 化合物 4-236 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz, δ ppm) :

2.42 (s, 3H) ; 3.50 (s, 2H) ; 4.06 (s, 3H) ; 7.18 (d, 1H) ; 7.58 (m, 1H) ; 7.60 (m, 1H) ; 7.88 (brs, 1H) ; 8.01 (m

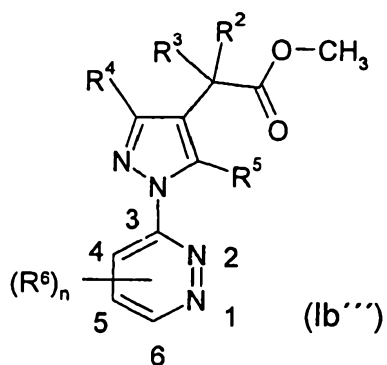
201011000

, 1H); 8.03 (*d*, 1H); 8.70 (*m*, 1H)。

NMR 化合物 4-237 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.43 (*s*, 3H); 3.47 (*s*, 2H); 7.44 (*m*, 1H); 7.48 (*m*,  
1H); 7.64 (*d*, 1H); 7.86 (*m*, 1H); 8.17 (*d*, 1H); 8.67  
(*m*, 1H)。

表 5： 式 (Ib''') 所示化合物



編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
5-1	H	H	Ph	Ph	H
5-2	H	H	Me	Ph	H
5-3	H	H	Me	5-I-2-噻吩基	H
5-4	H	H	Me	2-咪喃基	H
5-5	H	H	Me	Ph	6-OMe
5-6	Me	H	Me	Ph	4-Me
5-7	H	H	Me	Ph	6-Cl
5-8	H	H	Me	Ph	4-CF <sub>3</sub>
5-9	H	H	Me	Ph	6-CF <sub>3</sub>
5-10	H	H	Me	Ph	4-Me
5-11	H	H	Me	Ph	4,6-Me <sub>2</sub>
5-12	H	H	Me	Ph	4,6-Cl <sub>2</sub>
5-13	H	H	Me	4-MeO-Ph	4-Me
5-14	H	H	Me	4-MeO-Ph	H
5-15	Me	H	Me	Ph	H
5-16	H	H	Me	4-Me-Ph	H
5-17	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
5-18	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Cl
5-19	H	H	Me	3-Cl-Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
5-20	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H
5-21	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Me
5-22	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
5-23	H	H	Me	3-Cl-Ph	4-Me
5-24	H	H	Me	2-Cl-Ph	4-Me
5-25	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
5-26	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	4-Me
5-27	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Me
5-28	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
5-29	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
5-30	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H
5-31	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-Cl
5-32	H	H	Me	Ph	4-Cl
5-33	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
5-34	H	H	Me	4-tBu-Ph	4-Me
5-35	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	4-Me
5-36	H	H	Me	Ph	4-OMe
5-37	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-OMe
5-38	H	H	Me	4-Me-Ph	4-Me
5-39	H	H	Me	4-F-Ph	4-Me
5-40	H	H	Me	4-F-Ph	4-Cl
5-41	H	H	Me	3-Me-Ph	4-Me
5-42	H	H	Me	4-COOH-Ph	4-Me
5-43	H	H	Me	3-Br-Ph	4-Me
5-44	H	H	Me	4-Ph-Ph	4-Me
5-45	H	H	Me	4-COOH-Ph	H
5-46	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	H
5-47	H	H	Me	Ph	4-SMe
5-48	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SMe

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
5-49	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H
5-50	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	H
5-51	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	4-Me
5-52	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	4-Me
5-53	H	H	Me	2-吡啶基	4-Cl
5-54	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-F
5-55	H	H	Me	2-噻吩基	4-Me
5-56	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	4-Me
5-57	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	4-Me
5-58	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Me
5-59	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Cl
5-60	H	H	Me	3-噻吩基	4-Me
5-61	H	H	Me	2-噻吩基	H
5-62	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	H
5-63	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	H
5-64	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
5-65	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基	H
5-66	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
5-67	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	H
5-68	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	4-Me
5-69	H	H	Me	3-噻吩基	H
5-70	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-S(O)Me
5-71	H	H	Me	4-Br-Ph	4-Me
5-72	H	H	Me	1,3-苯並二噁茂-5-基	4-Me
5-73	H	H	Me	4-I-Ph	4-Me
5-74	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
5-75	H	H	Me	4-PhO-Ph	4-Me
5-76	H	H	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
5-77	H	H	Me	Ph	4-S(O)Me

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
5-78	H	H	H	Ph	H
5-79	H	H	H	Ph	4-Me
5-80	H	H	Et	Ph	H
5-81	H	H	n-Pr	Ph	H
5-82	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	H
5-83	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	H
5-84	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	H
5-85	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	H
5-86	H	H	Cl	Ph	H
5-87	H	H	Et	Ph	4-Me
5-88	H	H	n-Pr	Ph	4-Me
5-89	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	4-Me
5-90	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	4-Me
5-91	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	4-Me
5-92	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	4-Me
5-93	H	H	Cl	Ph	4-Me
5-94	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
5-95	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
5-96	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Cl-Ph	H
5-97	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
5-98	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Cl-Ph	H
5-99	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
5-100	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
5-101	H	H	Et	4-Me-Ph	H
5-102	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H
5-103	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Me-Ph	H
5-104	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H
5-105	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Me-Ph	H
5-106	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
5-107	H	H	Cl	4-Me-Ph	H
5-108	H	H	Et	2-吡啶基	H
5-109	H	H	n-Pr	2-吡啶基	H
5-110	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	2-吡啶基	H
5-111	H	H	CHCl <sub>2</sub>	2-吡啶基	H
5-112	H	H	CH <sub>2</sub> F	2-吡啶基	H
5-113	H	H	CHF <sub>2</sub>	2-吡啶基	H
5-114	H	H	Cl	2-吡啶基	H
5-115	H	H	Me	2-吡啶基	H
5-116	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
5-117	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Cl
5-118	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Me
5-119	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
5-120	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Cl
5-121	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Me
5-122	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
5-123	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
5-124	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	4-Me
5-125	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
5-126	H	H	Me	4-(CH <sub>2</sub> COOH)-Ph	4-Me
5-127	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	4-Me
5-128	H	H	Me	4-Br-Ph	4-Me
5-129	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	H
5-130	H	H	Me	3-Me-Ph	H
5-131	H	H	Me	4-F-Ph	H
5-132	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
5-133	H	H	Me	4-tBu-Ph	H
5-134	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
5-135	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	4-Me

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
5-136	H	H	Me	3-吡啶基	H
5-137	H	H	Me	4-吡啶基	H
5-138	H	H	C(O)OMe	Ph	H
5-139	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
5-140	H	H	Me	4-Cl-Ph	4-SO <sub>2</sub> Me
5-141	H	H	Me	3-吡啶基	4-Me
5-142	H	H	Me	2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph	4-Me
5-143	H	H	Me	2-吡啶基	4-Me
5-144	H	H	H	4-Cl-Ph	4-Me
5-145	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
5-146	H	H	Me	Ph	4-Me
5-147	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
5-148	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Me
5-149	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Cl
5-150	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-F
5-151	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H
5-152	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H
5-153	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
5-154	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
5-155	H	H	Me	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基	H
5-156	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
5-157	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
5-158	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
5-159	H	H	CN	4-Cl-Ph	4-Me
5-160	H	H	CN	4-Me-Ph	H
5-161	H	H	CN	4-Me-Ph	4-Me
5-162	H	H	CN	Ph	H
5-163	H	H	CN	Ph	4-Me
5-164	H	H	CN	2-吡啶基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
5-165	H	H	CN	3-吡啶基	H
5-166	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H
5-167	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H
5-168	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
5-169	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H
5-170	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
5-171	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
5-172	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
5-173	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
5-174	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
5-175	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
5-176	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	H
5-177	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	4-Me
5-178	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	H
5-179	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	4-Me
5-180	H	H	甲醯基	Ph	H
5-181	H	H	甲醯基	Ph	4-Me
5-182	H	H	甲醯基	2-吡啶基	H
5-183	H	H	甲醯基	3-吡啶基	H
5-184	H	H	甲醯基	5-Cl-吡啶-2-基	H
5-185	H	H	甲醯基	5-Br-吡啶-2-基	H
5-186	H	H	甲醯基	5-F-吡啶-2-基	H
5-187	H	H	甲醯基	5-Me-吡啶-2-基	H
5-188	H	H	甲醯基	6-Me-吡啶-3-基	H
5-189	H	H	甲醯基	4-Me-吡啶-2-基	H
5-190	H	H	甲醯基	4-F-吡啶-2-基	H
5-191	H	H	甲醯基	4-Cl-吡啶-2-基	H
5-192	H	H	甲醯基	4-Br-吡啶-2-基	H
5-193	H	H	甲醯基	4-OMe-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
5-194	H	H	CH <sub>2</sub> OH	5-Me-吡啶-2-基	H
5-195	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Cl-Ph	H
5-196	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-吡啶-2-基	H
5-197	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-Ph	H
5-198	H	H	CH <sub>2</sub> OH	Ph	H
5-199	H	H	CH <sub>2</sub> OH	2-吡啶基	H
5-200	H	H	Me	2-噻唑基	H
5-201	H	H	Me	2-噻唑基	4-Cl
5-202	H	H	Me	2-噻唑基	4-Me
5-203	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
5-204	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Cl
5-205	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	4-Me
5-206	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
5-207	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
5-208	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	4-Me
5-209	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
5-210	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
5-211	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	4-Me
5-212	H	H	Me	2-吡啶基	4-F
5-213	H	H	Me	2-吡嗪基	H
5-214	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
5-215	H	H	Me	2-吡嗪基	4-Me
5-216	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	H
5-217	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	4-Me
5-218	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
5-219	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	H
5-220	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	4-Me
5-221	H	H	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
5-222	H	H	Me	4,5-Cl <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
5-223	H	H	Me	2-嘧啶基	H
5-224	H	H	Me	2-嘧啶基	4-Me
5-225	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
5-226	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
5-227	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
5-228	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
5-229	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	4-Me
5-230	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
5-231	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	4-Me
5-232	H	H	Me	3-噁嗪基	H
5-233	H	H	Me	6-Me-噁嗪-3-基	H
5-234	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基	H
5-235	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H
5-236	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Me-6-Cl
5-237	H	H	Me	4-Cl-Ph	6-Cl
5-238	H	H	Me	2-吡啶基	6-Cl
5-239	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
5-240	H	H	Me	異喹啉-3-基	H
5-241	H	H	Me	喹啉-2-基	H

此外，測得本發明之通式(I)化合物的 NMR 數據。代表化合物的 NMR 分別以 400 MHz 之 <sup>1</sup>H-NMR 光譜的形式記錄(CDCl<sub>3</sub>) (<sup>1</sup>H 核磁共振數據)。部份例示化合物之特徵化學位移 δ (ppm)示於下文：

NMR 化合物 5-236 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz, δ ppm) :

2.37 (s, 3H) ; 2.43 (s, 3H) ; 3.35 (s, 2H) ; 3.69 (s, 3H)

; 7.22 (*d*, 2H); 7.35 (*d*, 2H); 7.90 (*s*, 1H)。

NMR 化合物 5-237 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.35 (*s*, 3H); 3.36 (*s*, 2H); 3.69 (*s*, 3H); 7.24 (*d*, 2H)  
; 7.37 (*d*, 2H); 7.52 (*d*, 1H); 8.01 (*d*, 1H)。

NMR 化合物 5-238 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.37 (*s*, 3H); 3.49 (*s*, 2H); 3.68 (*s*, 3H); 7.30 (*m*, 1H)  
; 7.54 (*m*, 1H); 7.56 (*d*, 1H); 7.80 (*m*, 1H); 8.05 (*d*,  
1H); 8.55 (*m*, 1H)。

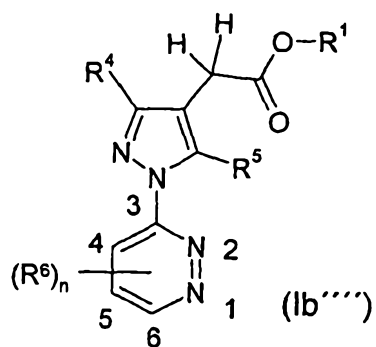
NMR 化合物 5-2 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.38 (*s*, 3H); 3.41 (*s*, 2H); 3.69 (*s*, 3H); 7.28 (*m*, 2H)  
; 7.39 (*m*, 3H); 7.55 (*dd*, 1H); 7.88 (*dd*, 1H); 9.02  
(*dd*, 1H)。

NMR 化合物 5-28 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.37 (*s*, 3H); 3.38 (*s*, 2H); 3.69 (*s*, 3H); 7.23 (*d*, 2H)  
; 7.38 (*d*, 2H); 7.57 (*dd*, 1H); 7.98 (*dd*, 1H); 9.01  
(*dd*, 1H)。

表 6： 式 (Ib''''') 所示化合物



編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
6-1	Et	Me	Ph	H
6-2	Et	Me	Ph	4-Me
6-3	Et	Me	3-Cl-Ph	H
6-4	Et	Me	4-Cl-Ph	H
6-5	Et	Me	4-Cl-Ph	4-Me
6-6	Et	Me	2-噻吩基	H
6-7	Et	Me	3-噻吩基	H
6-8	Et	Me	3-Me-2-噻吩基	H
6-9	Et	Me	4-Me-2-噻吩基	H
6-10	Et	Me	5-Br-2-噻吩基	H
6-11	Et	Me	5-Br-2-噻吩基	4-Me
6-12	Et	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
6-13	Et	Me	5-Cl-2-噻吩基	4-Me
6-14	Et	Me	5-I-2-噻吩基	H
6-15	Et	Me	5-Me-2-噻吩基	H
6-16	Et	Me	3-吡啶基	H
6-17	Et	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
6-18	Et	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
6-19	Et	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-20	Et	Me	4-Me-Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
6-21	Et	Me	4-Me-Ph	4-Me
6-22	Et	Me	4-Br-Ph	H
6-23	Et	Me	4-F-Ph	H
6-24	Et	Me	4-F-Ph	4-Me
6-25	Et	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-26	Et	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-27	Et	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-28	Et	Me	5-F-吡啶-2-基	4-Me
6-29	Et	Me	5-Cl-吡啶-2-基	4-Me
6-30	Et	Me	5-Br-吡啶-2-基	4-Me
6-31	Et	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-32	Et	Me	5-Me-吡啶-2-基	4-Me
6-33	Et	Me	2-吡啶基	4-Me
6-34	Et	Me	2-吡啶基	H
6-35	Et	Me	4-吡啶基	H
6-36	Et	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
6-37	Et	Me	4-Me-吡啶-2-基	4-Me
6-38	Et	Me	2-噻唑基	H
6-39	Et	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
6-40	Et	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
6-41	Et	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
6-42	Et	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
6-43	Et	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
6-44	Et	Me	4,5-Cl <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
6-45	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
6-46	Et	Me	2-吡嗪基	H
6-47	Et	Me	2-嘧啶基	H
6-48	Et	Me	2-嘧啶基	4-Me
6-49	Et	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
6-50	Et	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
6-51	Et	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
6-52	Et	Me	5-Me-嘧啶-2-基	4-Me
6-53	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
6-54	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	4-Me
6-55	Et	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	H
6-56	Et	Me	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
6-57	Et	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡唑-3-基	H
6-58	Et	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
6-59	Et	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
6-60	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
6-61	Et	Me	3-噻嗪基	H
6-62	Et	Me	6-Me-噻嗪-3-基	H
6-63	Et	Me	1,2,4)-三嗪-3-基	H
6-64	Et	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H
6-65	Pr	Me	Ph	H
6-66	Pr	Me	4-Cl-Ph	H
6-67	Pr	Me	2-噻吩基	H
6-68	Pr	Me	3-吡啶基	H
6-69	Pr	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-70	Pr	Me	4-Me-Ph	H
6-71	Pr	Me	4-Br-Ph	H
6-72	Pr	Me	4-F-Ph	H
6-73	Pr	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-74	Pr	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-75	Pr	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-76	Pr	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-77	Pr	Me	2-吡啶基	H
6-78	Pr	Me	4-吡啶基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
6-79	i-Pr	Me	Ph	H
6-80	i-Pr	Me	4-Cl-Ph	H
6-81	i-Pr	Me	2-噻吩基	H
6-82	i-Pr	Me	3-吡啶基	H
6-83	i-Pr	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-84	i-Pr	Me	4-Me-Ph	H
6-85	i-Pr	Me	4-Br-Ph	H
6-86	i-Pr	Me	4-F-Ph	H
6-87	i-Pr	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-88	i-Pr	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-89	i-Pr	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-90	i-Pr	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-91	i-Pr	Me	2-吡啶基	H
6-92	i-Pr	Me	4-吡啶基	H
6-93	CH <sub>2</sub> Ph	Me	Ph	H
6-94	CH <sub>2</sub> Ph	Me	4-Cl-Ph	H
6-95	CH <sub>2</sub> Ph	Me	2-噻吩基	H
6-96	CH <sub>2</sub> Ph	Me	2-吡啶基	H
6-97	丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
6-98	丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-99	丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-100	丙-2-炔-1-基	Me	3-噻吩基	H
6-101	丙-2-炔-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
6-102	丙-2-炔-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
6-103	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
6-104	丙-2-炔-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
6-105	丙-2-炔-1-基	Me	3-吡啶基	H
6-106	丙-2-炔-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
6-107	丙-2-炔-1-基	H	Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
6-108	丙-2-炔-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-109	丙-2-炔-1-基	Me	4-Me-Ph	H
6-110	丙-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
6-111	丙-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
6-112	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-113	丙-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-114	丙-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-115	丙-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-116	丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-117	丙-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
6-118	丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
6-119	丙-2-炔-1-基	Me	Ph	4-Me
6-120	環丙基甲基	Me	Ph	H
6-121	環丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-122	環丙基甲基	Me	2-噻吩基	H
6-123	環丙基甲基	Me	3-噻吩基	H
6-124	環丙基甲基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
6-125	環丙基甲基	Me	3-吡啶基	H
6-126	環丙基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
6-127	環丙基甲基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
6-128	環丙基甲基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
6-129	環丙基甲基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
6-130	環丙基甲基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
6-131	環丙基甲基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-132	環丙基甲基	Me	4-Me-Ph	H
6-133	環丙基甲基	Me	4-Br-Ph	H
6-134	環丙基甲基	Me	4-F-Ph	H
6-135	環丙基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-136	環丙基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
6-137	環丙基甲基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-138	環丙基甲基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-139	環丙基甲基	Me	2-吡啶基	H
6-140	環丙基甲基	Me	4-吡啶基	H
6-141	環丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
6-142	環丙基甲基	Me	Ph	4-Me
6-143	環丙基甲基	H	Ph	H
6-144	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
6-145	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-146	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-147	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-148	(1-甲基環丙基)甲基	Me	Ph	H
6-149	(1-甲基環丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-150	(1-甲基環丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H
6-151	(1-甲基環丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H
6-152	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
6-153	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-154	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-155	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-156	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	Ph	H
6-157	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-158	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H
6-159	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H
6-160	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
6-161	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-162	丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-163	丁-2-炔-1-基	Me	3-噻吩基	H
6-164	丁-2-炔-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
6-165	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
6-166	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
6-167	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
6-168	丁-2-炔-1-基	Me	3-吡啶基	H
6-169	丁-2-炔-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
6-170	丁-2-炔-1-基	H	Ph	H
6-171	丁-2-炔-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-172	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-Ph	H
6-173	丁-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
6-174	丁-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
6-175	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-176	丁-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-177	丁-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-178	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-179	丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-180	丁-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
6-181	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
6-182	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	4-Me
6-183	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
6-184	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-185	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-186	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-187	1-環丙基乙基	Me	Ph	H
6-188	1-環丙基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
6-189	1-環丙基乙基	Me	2-噻吩基	H
6-190	1-環丙基乙基	Me	2-吡啶基	H
6-191	烯丙基	Me	Ph	H
6-192	烯丙基	Me	4-Cl-Ph	H
6-193	烯丙基	Me	2-噻吩基	H
6-194	烯丙基	Me	2-吡啶基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
6-195	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H
6-196	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-197	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-198	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-199	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
6-200	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-201	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-202	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-203	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H
6-204	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-205	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-206	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-207	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
6-208	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-209	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-210	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-211	環丁基甲基	Me	Ph	H
6-212	環丁基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-213	環丁基甲基	Me	2-噻吩基	H
6-214	環丁基甲基	Me	2-吡啶基	H
6-215	環戊基甲基	Me	Ph	H
6-216	環戊基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-217	環戊基甲基	Me	2-噻吩基	H
6-218	環戊基甲基	Me	2-吡啶基	H
6-219	環己基甲基	Me	Ph	H
6-220	環己基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-221	環己基甲基	Me	2-噻吩基	H
6-222	環己基甲基	Me	2-吡啶基	H
6-223	丁-3-烯-1-基	Me	Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
6-224	丁-3-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-225	丁-3-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-226	丁-3-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-227	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
6-228	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-229	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
6-230	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	3-噻吩基	H
6-231	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
6-232	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
6-233	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
6-234	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
6-235	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	3-吡啶基	H
6-236	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
6-237	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
6-238	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-239	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-Ph	H
6-240	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Br-Ph	H
6-241	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-F-Ph	H
6-242	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-243	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-244	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-245	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-246	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
6-247	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-吡啶基	H
6-248	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	4-Me
6-249	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	Ph	4-Me
6-250	2-氯丙-2-烯-1-基	H	Ph	H
6-251	2-甲氧基乙基	Me	Ph	H
6-252	2-甲氧基乙基	Me	4-Cl-Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
6-253	2-甲氧基乙基	Me	2-噻吩基	H
6-254	2-甲氧基乙基	Me	2-吡啶基	H
6-255	四氫呋喃-2-基甲基	Me	Ph	H
6-256	四氫呋喃-2-基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-257	四氫呋喃-2-基甲基	Me	2-噻吩基	H
6-258	四氫呋喃-2-基甲基	Me	2-吡啶基	H
6-259	2-(二甲基氨基)乙基	Me	Ph	H
6-260	2-(二甲基氨基)乙基	Me	4-Cl-Ph	H
6-261	2-(二甲基氨基)乙基	Me	2-噻吩基	H
6-262	2-(二甲基氨基)乙基	Me	2-吡啶基	H
6-263	氧雜環丁烷-3-基	Me	Ph	H
6-264	氧雜環丁烷-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-265	氧雜環丁烷-3-基	Me	2-噻吩基	H
6-266	氧雜環丁烷-3-基	Me	2-吡啶基	H
6-267	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	Ph	H
6-268	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-269	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	2-噻吩基	H
6-270	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	2-吡啶基	H
6-271	2,2,2-三氟乙基	Me	Ph	H
6-272	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
6-273	2,2,2-三氟乙基	Me	2-噻吩基	H
6-274	2,2,2-三氟乙基	Me	3-吡啶基	H
6-275	2,2,2-三氟乙基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-276	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Me-Ph	H
6-277	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
6-278	2,2,2-三氟乙基	Me	4-F-Ph	H
6-279	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-280	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-281	2,2,2-三氟乙基	Me	5-F-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
6-282	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-283	2,2,2-三氟乙基	Me	2-吡啶基	H
6-284	2,2,2-三氟乙基	Me	4-吡啶基	H
6-285	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	Ph	H
6-286	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
6-287	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	2-噻吩基	H
6-288	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	3-吡啶基	H
6-289	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-290	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
6-291	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
6-292	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-F-Ph	H
6-293	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-294	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-295	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-296	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-297	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	2-吡啶基	H
6-298	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-吡啶基	H
6-299	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	Ph	H
6-300	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
6-301	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	2-噻吩基	H
6-302	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	3-吡啶基	H
6-303	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-304	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
6-305	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
6-306	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-F-Ph	H
6-307	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-308	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-309	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-310	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
6-311	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	2-吡啶基	H
6-312	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-吡啶基	H
6-313	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	Ph	H
6-314	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
6-315	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	2-噻吩基	H
6-316	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	3-吡啶基	H
6-317	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-318	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
6-319	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
6-320	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-F-Ph	H
6-321	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-322	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-323	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-324	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-325	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	2-吡啶基	H
6-326	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-吡啶基	H
6-327	2,2-二氟乙基	Me	Ph	H
6-328	2,2-二氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
6-329	2,2-二氟乙基	Me	2-噻吩基	H
6-330	2,2-二氟乙基	Me	2-吡啶基	H
6-331	Ph	Me	Ph	H
6-332	Ph	Me	4-Cl-Ph	H
6-333	Ph	Me	2-噻吩基	H
6-334	Ph	Me	2-吡啶基	H
6-335	2-氟乙基	Me	Ph	H
6-336	2-氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
6-337	2-氟乙基	Me	2-噻吩基	H
6-338	2-氟乙基	Me	2-吡啶基	H
6-339	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	Ph	H

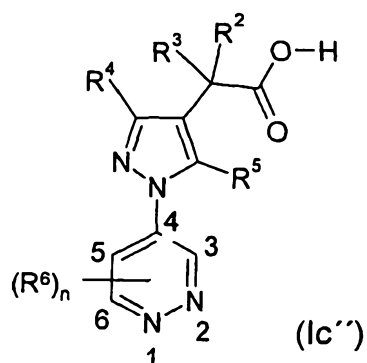
編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
6-340	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
6-341	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-噻吩基	H
6-342	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-吡啶基	H
6-343	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	Ph	H
6-344	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	4-Cl-Ph	H
6-345	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	2-噻吩基	H
6-346	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	2-吡啶基	H
6-347	Et	Me	2-吡啶基	6-Cl
6-348	丁-3-炔-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
6-349	丁-3-炔-2-基	Me	異喹啉-3-基	H
6-350	丁-3-炔-2-基	Me	喹啉-2-基	H
6-351	丁-3-炔-2-基	Me	Ph	H
6-352	丁-3-炔-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
6-353	丁-3-炔-2-基	Me	2-噻吩基	H
6-354	丁-3-炔-2-基	Me	3-吡啶基	H
6-355	丁-3-炔-2-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
6-356	丁-3-炔-2-基	Me	4-Me-Ph	H
6-357	丁-3-炔-2-基	Me	4-Br-Ph	H
6-358	丁-3-炔-2-基	Me	4-F-Ph	H
6-359	丁-3-炔-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
6-360	丁-3-炔-2-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
6-361	丁-3-炔-2-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
6-362	丁-3-炔-2-基	Me	2-吡啶基	H
6-363	丁-3-炔-2-基	Me	4-吡啶基	H
6-364	Et	Me	異喹啉-3-基	H
6-365	Et	Me	喹啉-2-基	H

此外，測得本發明之通式(I)化合物的 NMR 數據。代表化合物的 NMR 分別以 400 MHz 之  $^1\text{H}$ -NMR 光譜的形式記錄 ( $\text{CDCl}_3$ ) ( $^1\text{H}$  核磁共振數據)。部份例示化合物之特徵化學位移  $\delta$  (ppm) 示於下文：

NMR 化合物 6-347 ( $\text{CDCl}_3$ , 400 MHz,  $\delta$  ppm) :

1.23 (*t*, 3H) ; 2.38 (*s*, 3H) ; 3.48 (*s*, 2H) ; 4.12 (*q*, 2H)  
; 7.41 (*m*, 1H) ; 7.57 (*d*, 1H) ; 7.68 (*m*, 1H) ; 7.93 (*m*,  
1H) ; 8.09 (*d*, 1H) ; 8.62 (*m*, 1H)。

表 7： 式 (Ic'') 所示化合物



編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
7-1	H	H	Ph	Ph	H
7-2	H	H	Me	Ph	H
7-3	H	H	Me	5-I-2-噻吩基	H
7-4	H	H	Me	2-咪喃基	H
7-5	Me	H	Me	Ph	5-Me
7-6	H	H	Me	Ph	5-CF <sub>3</sub>
7-7	H	H	Me	Ph	5-Me
7-8	H	H	Me	4-MeO-Ph	5-Me
7-9	H	H	Me	4-MeO-Ph	H
7-10	Me	H	Me	Ph	H
7-11	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me
7-12	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Cl
7-13	H	H	Me	4-Me-Ph	H
7-14	H	H	Me	3-Cl-Ph	H
7-15	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H
7-16	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Me
7-17	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
7-18	H	H	Me	3-Cl-Ph	5-Me
7-19	H	H	Me	2-Cl-Ph	5-Me

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
7-20	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
7-21	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Me
7-22	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Me
7-23	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
7-24	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
7-25	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H
7-26	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Cl
7-27	H	H	Me	Ph	5-Cl
7-28	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
7-29	H	H	Me	4-tBu-Ph	5-Me
7-30	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	5-Me
7-31	H	H	Me	Ph	5-OMe
7-32	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-OMe
7-33	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me
7-34	H	H	Me	4-F-Ph	5-Cl
7-35	H	H	Me	4-F-Ph	5-Me
7-36	H	H	Me	3-Me-Ph	5-Me
7-37	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	5-Me
7-38	H	H	Me	3-Br-Ph	5-Me
7-39	H	H	Me	4-Ph-Ph	5-Me
7-40	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	H
7-41	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	H
7-42	H	H	Me	Ph	5-SMe
7-43	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SMe
7-44	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H
7-45	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	H
7-46	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	5-Me
7-47	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	5-Me
7-48	H	H	Me	2-吡啶基	5-Cl

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
7-49	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-F
7-50	H	H	Me	2-噻吩基	5-Me
7-51	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	5-Me
7-52	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	5-Me
7-53	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Me
7-54	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Cl
7-55	H	H	Me	3-噻吩基	5-Me
7-56	H	H	Me	2-噻吩基	H
7-57	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	H
7-58	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	H
7-59	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
7-60	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基	H
7-61	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
7-62	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	H
7-63	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	5-Me
7-64	H	H	Me	3-噻吩基	H
7-65	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-S(O)Me
7-66	H	H	Me	4-Br-Ph	5-Me
7-67	H	H	Me	1,3-苯並二噁茂-5-基	5-Me
7-68	H	H	Me	4-I-Ph	5-Me
7-69	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
7-70	H	H	Me	4-PhO-Ph	5-Me
7-71	H	H	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
7-72	H	H	Me	Ph	5-S(O)Me
7-73	H	H	H	Ph	H
7-74	H	H	H	Ph	5-Me
7-75	H	H	Et	Ph	H
7-76	H	H	n-Pr	Ph	H
7-77	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
7-78	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	H
7-79	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	H
7-80	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	H
7-81	H	H	Cl	Ph	H
7-82	H	H	Et	Ph	5-Me
7-83	H	H	n-Pr	Ph	5-Me
7-84	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	5-Me
7-85	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	5-Me
7-86	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	5-Me
7-87	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	5-Me
7-88	H	H	Cl	Ph	5-Me
7-89	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
7-90	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
7-91	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Cl-Ph	H
7-92	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
7-93	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Cl-Ph	H
7-94	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
7-95	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
7-96	H	H	Et	4-Me-Ph	H
7-97	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H
7-98	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Me-Ph	H
7-99	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H
7-100	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Me-Ph	H
7-101	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H
7-102	H	H	Cl	4-Me-Ph	H
7-103	H	H	Et	2-吡啶基	H
7-104	H	H	n-Pr	2-吡啶基	H
7-105	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	2-吡啶基	H
7-106	H	H	CHCl <sub>2</sub>	2-吡啶基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
7-107	H	H	CH <sub>2</sub> F	2-吡啶基	H
7-108	H	H	CHF <sub>2</sub>	2-吡啶基	H
7-109	H	H	Cl	2-吡啶基	H
7-110	H	H	Me	2-吡啶基	H
7-111	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
7-112	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Cl
7-113	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Me
7-114	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
7-115	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Cl
7-116	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Me
7-117	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
7-118	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
7-119	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	5-Me
7-120	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
7-121	H	H	Me	4-CH <sub>2</sub> COOH-Ph	5-Me
7-122	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	5-Me
7-123	H	H	Me	4-Br-Ph	H
7-124	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	H
7-125	H	H	Me	3-Me-Ph	H
7-126	H	H	Me	4-F-Ph	H
7-127	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
7-128	H	H	Me	4-tBu-Ph	H
7-129	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
7-130	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	5-Me
7-131	H	H	Me	3-吡啶基	H
7-132	H	H	Me	4-吡啶基	H
7-133	H	H	C(O)OMe	Ph	H
7-134	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
7-135	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SO <sub>2</sub> Me

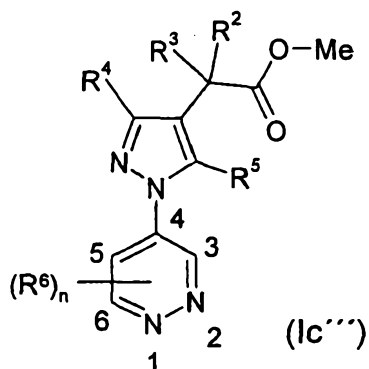
編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
7-136	H	H	Me	3-吡啶基	5-Me
7-137	H	H	Me	2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
7-138	H	H	Me	2-吡啶基	5-Me
7-139	H	H	H	4-Cl-Ph	5-Me
7-140	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
7-141	H	H	Me	Ph	5-Me
7-142	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
7-143	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Me
7-144	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Cl
7-145	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-F
7-146	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H
7-147	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H
7-148	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
7-149	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
7-150	H	H	Me	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基	H
7-151	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
7-152	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
7-153	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
7-154	H	H	CN	4-Cl-Ph	5-Me
7-155	H	H	CN	4-Me-Ph	H
7-156	H	H	CN	4-Me-Ph	5-Me
7-157	H	H	CN	Ph	H
7-158	H	H	CN	Ph	5-Me
7-159	H	H	CN	2-吡啶基	H
7-160	H	H	CN	3-吡啶基	H
7-161	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H
7-162	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H
7-163	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
7-164	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
7-165	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
7-166	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
7-167	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
7-168	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
7-169	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
7-170	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
7-171	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	H
7-172	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	5-Me
7-173	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	H
7-174	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	5-Me
7-175	H	H	甲醯基	Ph	H
7-176	H	H	甲醯基	Ph	5-Me
7-177	H	H	甲醯基	2-吡啶基	H
7-178	H	H	甲醯基	3-吡啶基	H
7-179	H	H	甲醯基	5-Cl-吡啶-2-基	H
7-180	H	H	甲醯基	5-Br-吡啶-2-基	H
7-181	H	H	甲醯基	5-F-吡啶-2-基	H
7-182	H	H	甲醯基	5-Me-吡啶-2-基	H
7-183	H	H	甲醯基	6-Me-吡啶-3-基	H
7-184	H	H	甲醯基	4-Me-吡啶-2-基	H
7-185	H	H	甲醯基	4-F-吡啶-2-基	H
7-186	H	H	甲醯基	4-Cl-吡啶-2-基	H
7-187	H	H	甲醯基	4-Br-吡啶-2-基	H
7-188	H	H	甲醯基	4-OMe-吡啶-2-基	H
7-189	H	H	CH <sub>2</sub> OH	5-Me-吡啶-2-基	H
7-190	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Cl-Ph	H
7-191	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-吡啶-2-基	H
7-192	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-Ph	H
7-193	H	H	CH <sub>2</sub> OH	Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
7-194	H	H	CH <sub>2</sub> OH	2-吡啶基	H
7-195	H	H	Me	2-噻唑基	H
7-196	H	H	Me	2-噻唑基	5-Cl
7-197	H	H	Me	2-噻唑基	5-Me
7-198	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
7-199	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Cl
7-200	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Me
7-201	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
7-202	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
7-203	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	5-Me
7-204	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
7-205	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
7-206	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	5-Me
7-207	H	H	Me	2-吡啶基	5-F
7-208	H	H	Me	2-吡嗪基	H
7-209	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
7-210	H	H	Me	2-吡嗪基	5-Me
7-211	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	H
7-212	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	5-Me
7-213	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
7-214	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	H
7-215	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	5-Me
7-216	H	H	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
7-217	H	H	Me	4,5-Cl <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
7-218	H	H	Me	2-嘧啶基	H
7-219	H	H	Me	2-嘧啶基	5-Me
7-220	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
7-221	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
7-222	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
7-223	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
7-224	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	5-Me
7-225	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
7-226	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	5-Me
7-227	H	H	Me	3-噻嗪基	H
7-228	H	H	Me	6-Me-噻嗪-3-基	H
7-229	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基	H
7-230	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H
7-231	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
7-232	H	H	Me	異喹啉-3-基	H
7-233	H	H	Me	喹啉-2-基	H

表 8 : 式 (Ic''') 所示化合物



編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
8-1	H	H	Ph	Ph	H
8-2	H	H	Me	Ph	H
8-3	H	H	Me	5-I-2-噻吩基	H
8-4	H	H	Me	2-呋喃基	H
8-5	Me	H	Me	Ph	5-Me
8-6	H	H	Me	Ph	5-CF <sub>3</sub>
8-7	H	H	Me	Ph	5-Me
8-8	H	H	Me	4-MeO-Ph	5-Me
8-9	H	H	Me	4-MeO-Ph	H
8-10	Me	H	Me	Ph	H
8-11	H	H	Me	4-Me-Ph	H
8-12	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me
8-13	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Cl
8-14	H	H	Me	3-Cl-Ph	H
8-15	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H
8-16	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Me
8-17	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
8-18	H	H	Me	3-Cl-Ph	5-Me
8-19	H	H	Me	2-Cl-Ph	5-Me

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
8-20	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
8-21	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Me
8-22	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Me
8-23	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
8-24	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
8-25	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H
8-26	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Cl
8-27	H	H	Me	Ph	5-Cl
8-28	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
8-29	H	H	Me	4-tBu-Ph	5-Me
8-30	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	5-Me
8-31	H	H	Me	Ph	5-OMe
8-32	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-OMe
8-33	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me
8-34	H	H	Me	4-F-Ph	5-Me
8-35	H	H	Me	4-F-Ph	5-Cl
8-36	H	H	Me	3-Me-Ph	5-Me
8-37	H	H	Me	4-COOH-Ph	5-Me
8-38	H	H	Me	3-Br-Ph	5-Me
8-39	H	H	Me	4-Ph-Ph	5-Me
8-40	H	H	Me	4-COOH-Ph	H
8-41	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	H
8-42	H	H	Me	Ph	5-SMe
8-43	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SMe
8-44	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H
8-45	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	H
8-46	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	5-Me
8-47	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	5-Me
8-48	H	H	Me	2-吡啶基	5-Cl

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
8-49	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-F
8-50	H	H	Me	2-噻吩基	5-Me
8-51	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	5-Me
8-52	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	5-Me
8-53	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Me
8-54	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Cl
8-55	H	H	Me	3-噻吩基	5-Me
8-56	H	H	Me	2-噻吩基	H
8-57	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	H
8-58	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	H
8-59	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
8-60	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基	H
8-61	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
8-62	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	H
8-63	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	5-Me
8-64	H	H	Me	3-噻吩基	H
8-65	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-S(O)Me
8-66	H	H	Me	4-Br-Ph	5-Me
8-67	H	H	Me	1,3-苯並二噁茂-5-基	5-Me
8-68	H	H	Me	4-I-Ph	5-Me
8-69	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
8-70	H	H	Me	4-PhO-Ph	5-Me
8-71	H	H	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
8-72	H	H	Me	Ph	5-S(O)Me
8-73	H	H	H	Ph	H
8-74	H	H	H	Ph	5-Me
8-75	H	H	Et	Ph	H
8-76	H	H	n-Pr	Ph	H
8-77	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
8-78	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	H
8-79	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	H
8-80	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	H
8-81	H	H	Cl	Ph	H
8-82	H	H	Et	Ph	5-Me
8-83	H	H	n-Pr	Ph	5-Me
8-84	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	5-Me
8-85	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	5-Me
8-86	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	5-Me
8-87	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	5-Me
8-88	H	H	Cl	Ph	5-Me
8-89	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
8-90	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
8-91	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Cl-Ph	H
8-92	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
8-93	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Cl-Ph	H
8-94	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
8-95	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
8-96	H	H	Et	4-Me-Ph	H
8-97	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H
8-98	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Me-Ph	H
8-99	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H
8-100	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Me-Ph	H
8-101	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H
8-102	H	H	Cl	4-Me-Ph	H
8-103	H	H	Et	2-吡啶基	H
8-104	H	H	n-Pr	2-吡啶基	H
8-105	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	2-吡啶基	H
8-106	H	H	CHCl <sub>2</sub>	2-吡啶基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
8-107	H	H	CH <sub>2</sub> F	2-吡啶基	H
8-108	H	H	CHF <sub>2</sub>	2-吡啶基	H
8-109	H	H	Cl	2-吡啶基	H
8-110	H	H	Me	2-吡啶基	H
8-111	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
8-112	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Cl
8-113	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Me
8-114	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
8-115	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Cl
8-116	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Me
8-117	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
8-118	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
8-119	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	5-Me
8-120	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
8-121	H	H	Me	4-(CH <sub>2</sub> COOH)-Ph	5-Me
8-122	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	5-Me
8-123	H	H	Me	4-Br-Ph	5-Me
8-124	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	H
8-125	H	H	Me	3-Me-Ph	H
8-126	H	H	Me	4-F-Ph	H
8-127	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
8-128	H	H	Me	4-tBu-Ph	H
8-129	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
8-130	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	5-Me
8-131	H	H	Me	3-吡啶基	H
8-132	H	H	Me	4-吡啶基	H
8-133	H	H	C(O)OMe	Ph	H
8-134	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
8-135	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SO <sub>2</sub> Me

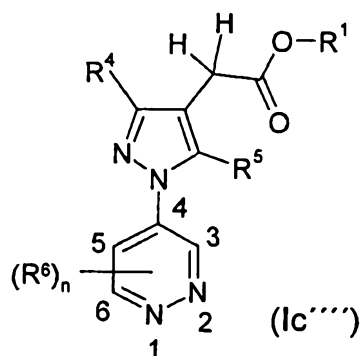
編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
8-136	H	H	Me	3-吡啶基	5-Me
8-137	H	H	Me	2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
8-138	H	H	Me	2-吡啶基	5-Me
8-139	H	H	H	4-Cl-Ph	5-Me
8-140	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
8-141	H	H	Me	Ph	5-Me
8-142	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
8-143	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Me
8-144	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Cl
8-145	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-F
8-146	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H
8-147	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H
8-148	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
8-149	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
8-150	H	H	Me	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基	H
8-151	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
8-152	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
8-153	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
8-154	H	H	CN	4-Cl-Ph	5-Me
8-155	H	H	CN	4-Me-Ph	H
8-156	H	H	CN	4-Me-Ph	5-Me
8-157	H	H	CN	Ph	H
8-158	H	H	CN	Ph	5-Me
8-159	H	H	CN	2-吡啶基	H
8-160	H	H	CN	3-吡啶基	H
8-161	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H
8-162	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H
8-163	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
8-164	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
8-165	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
8-166	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
8-167	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
8-168	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
8-169	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
8-170	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
8-171	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	H
8-172	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	5-Me
8-173	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	H
8-174	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	5-Me
8-175	H	H	甲醯基	Ph	H
8-176	H	H	甲醯基	Ph	5-Me
8-177	H	H	甲醯基	2-吡啶基	H
8-178	H	H	甲醯基	3-吡啶基	H
8-179	H	H	甲醯基	5-Cl-吡啶-2-基	H
8-180	H	H	甲醯基	5-Br-吡啶-2-基	H
8-181	H	H	甲醯基	5-F-吡啶-2-基	H
8-182	H	H	甲醯基	5-Me-吡啶-2-基	H
8-183	H	H	甲醯基	6-Me-吡啶-3-基	H
8-184	H	H	甲醯基	4-Me-吡啶-2-基	H
8-185	H	H	甲醯基	4-F-吡啶-2-基	H
8-186	H	H	甲醯基	4-Cl-吡啶-2-基	H
8-187	H	H	甲醯基	4-Br-吡啶-2-基	H
8-188	H	H	甲醯基	4-OMe-吡啶-2-基	H
8-189	H	H	CH <sub>2</sub> OH	5-Me-吡啶-2-基	H
8-190	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Cl-Ph	H
8-191	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-吡啶-2-基	H
8-192	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-Ph	H
8-193	H	H	CH <sub>2</sub> OH	Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
8-194	H	H	CH <sub>2</sub> OH	2-吡啶基	H
8-195	H	H	Me	2-噻唑基	H
8-196	H	H	Me	2-噻唑基	5-Cl
8-197	H	H	Me	2-噻唑基	5-Me
8-198	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
8-199	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Cl
8-200	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Me
8-201	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
8-202	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
8-203	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	5-Me
8-204	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
8-205	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
8-206	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	5-Me
8-207	H	H	Me	2-吡啶基	5-F
8-208	H	H	Me	2-吡嗪基	H
8-209	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
8-210	H	H	Me	2-吡嗪基	5-Me
8-211	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	H
8-212	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	5-Me
8-213	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
8-214	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	H
8-215	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	5-Me
8-216	H	H	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
8-217	H	H	Me	4,5-Cl <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
8-218	H	H	Me	2-嘧啶基	H
8-219	H	H	Me	2-嘧啶基	5-Me
8-220	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
8-221	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
8-222	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
8-223	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
8-224	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	5-Me
8-225	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
8-226	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	5-Me
8-227	H	H	Me	3-噻嗪基	H
8-228	H	H	Me	6-Me-噻嗪-3-基	H
8-229	H	H	Me	3-(1,2,4)-三嗪基	H
8-230	H	H	Me	6-Me-(1,2,4)-三嗪-3-基	H
8-231	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
8-232	H	H	Me	異喹啉-3-基	H
8-233	H	H	Me	喹啉-2-基	H

表 9： 式 (Ic''') 所示化合物



編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
9-1	Et	Me	Ph	H
9-2	Et	Me	Ph	5-Me
9-3	Et	Me	3-Cl-Ph	H
9-4	Et	Me	4-Cl-Ph	H
9-5	Et	Me	4-Cl-Ph	5-Me
9-6	Et	Me	2-噻吩基	H
9-7	Et	Me	3-噻吩基	H
9-8	Et	Me	3-Me-2-噻吩基	H
9-9	Et	Me	4-Me-2-噻吩基	H
9-10	Et	Me	5-Br-2-噻吩基	H
9-11	Et	Me	5-Br-2-噻吩基	5-Me
9-12	Et	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
9-13	Et	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Me
9-14	Et	Me	5-I-2-噻吩基	H
9-15	Et	Me	5-Me-2-噻吩基	H
9-16	Et	Me	3-吡啶基	H
9-17	Et	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
9-18	Et	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
9-19	Et	Me	6-Me-吡啶-3-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
9-20	Et	Me	4-Me-Ph	H
9-21	Et	Me	4-Me-Ph	5-Me
9-22	Et	Me	4-Br-Ph	H
9-23	Et	Me	4-F-Ph	H
9-24	Et	Me	4-F-Ph	5-Me
9-25	Et	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-26	Et	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-27	Et	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-28	Et	Me	5-F-吡啶-2-基	5-Me
9-29	Et	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Me
9-30	Et	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Me
9-31	Et	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-32	Et	Me	5-Me-吡啶-2-基	5-Me
9-33	Et	Me	2-吡啶基	5-Me
9-34	Et	Me	2-吡啶基	H
9-35	Et	Me	4-吡啶基	H
9-36	Et	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
9-37	Et	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Me
9-38	Et	Me	2-噻唑基	H
9-39	Et	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
9-40	Et	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
9-41	Et	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
9-42	Et	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
9-43	Et	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
9-44	Et	Me	4,5-Cl <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
9-45	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
9-46	Et	Me	2-吡嗪基	H
9-47	Et	Me	2-嘧啶基	H
9-48	Et	Me	2-嘧啶基	5-Me

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
9-49	Et	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
9-50	Et	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
9-51	Et	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
9-52	Et	Me	5-Me-嘧啶-2-基	5-Me
9-53	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
9-54	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	5-Me
9-55	Et	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	H
9-56	Et	Me	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
9-57	Et	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡唑-3-基	H
9-58	Et	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
9-59	Et	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
9-60	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
9-61	Et	Me	3-噻嗪基	H
9-62	Et	Me	6-Me-噻嗪-3-基	H
9-63	Et	Me	1,2,4-三嗪-3-基	H
9-64	Et	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H
9-65	Pr	Me	Ph	H
9-66	Pr	Me	4-Cl-Ph	H
9-67	Pr	Me	2-噻吩基	H
9-68	Pr	Me	3-吡啶基	H
9-69	Pr	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-70	Pr	Me	4-Me-Ph	H
9-71	Pr	Me	4-Br-Ph	H
9-72	Pr	Me	4-F-Ph	H
9-73	Pr	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-74	Pr	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-75	Pr	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-76	Pr	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-77	Pr	Me	2-吡啶基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
9-78	Pr	Me	4-吡啶基	H
9-79	i-Pr	Me	Ph	H
9-80	i-Pr	Me	4-Cl-Ph	H
9-81	i-Pr	Me	2-噻吩基	H
9-82	i-Pr	Me	3-吡啶基	H
9-83	i-Pr	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-84	i-Pr	Me	4-Me-Ph	H
9-85	i-Pr	Me	4-Br-Ph	H
9-86	i-Pr	Me	4-F-Ph	H
9-87	i-Pr	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-88	i-Pr	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-89	i-Pr	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-90	i-Pr	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-91	i-Pr	Me	2-吡啶基	H
9-92	i-Pr	Me	4-吡啶基	H
9-93	CH <sub>2</sub> Ph	Me	Ph	H
9-94	CH <sub>2</sub> Ph	Me	4-Cl-Ph	H
9-95	CH <sub>2</sub> Ph	Me	2-噻吩基	H
9-96	CH <sub>2</sub> Ph	Me	2-吡啶基	H
9-97	丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
9-98	丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-99	丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-100	丙-2-炔-1-基	Me	3-噻吩基	H
9-101	丙-2-炔-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
9-102	丙-2-炔-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
9-103	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
9-104	丙-2-炔-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
9-105	丙-2-炔-1-基	Me	3-吡啶基	H
9-106	丙-2-炔-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
9-107	丙-2-炔-1-基	H	Ph	H
9-108	丙-2-炔-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-109	丙-2-炔-1-基	Me	4-Me-Ph	H
9-110	丙-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
9-111	丙-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
9-112	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-113	丙-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-114	丙-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-115	丙-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-116	丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-117	丙-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
9-118	丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
9-119	丙-2-炔-1-基	Me	Ph	5-Me
9-120	環丙基甲基	Me	Ph	H
9-121	環丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-122	環丙基甲基	Me	2-噻吩基	H
9-123	環丙基甲基	Me	3-噻吩基	H
9-124	環丙基甲基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
9-125	環丙基甲基	Me	3-吡啶基	H
9-126	環丙基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
9-127	環丙基甲基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
9-128	環丙基甲基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
9-129	環丙基甲基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
9-130	環丙基甲基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
9-131	環丙基甲基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-132	環丙基甲基	Me	4-Me-Ph	H
9-133	環丙基甲基	Me	4-Br-Ph	H
9-134	環丙基甲基	Me	4-F-Ph	H
9-135	環丙基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
9-136	環丙基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-137	環丙基甲基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-138	環丙基甲基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-139	環丙基甲基	Me	2-吡啶基	H
9-140	環丙基甲基	Me	4-吡啶基	H
9-141	環丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
9-142	環丙基甲基	Me	Ph	5-Me
9-143	環丙基甲基	H	Ph	H
9-144	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
9-145	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-146	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-147	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-148	(1-甲基環丙基)甲基	Me	Ph	H
9-149	(1-甲基環丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-150	(1-甲基環丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H
9-151	(1-甲基環丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H
9-152	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
9-153	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-154	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-155	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-156	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	Ph	H
9-157	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-158	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H
9-159	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H
9-160	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
9-161	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-162	丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-163	丁-2-炔-1-基	Me	3-噻吩基	H
9-164	丁-2-炔-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
9-165	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
9-166	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
9-167	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
9-168	丁-2-炔-1-基	Me	3-吡啶基	H
9-169	丁-2-炔-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
9-170	丁-2-炔-1-基	H	Ph	H
9-171	丁-2-炔-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-172	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-Ph	H
9-173	丁-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
9-174	丁-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
9-175	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-176	丁-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-177	丁-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-178	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-179	丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-180	丁-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
9-181	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
9-182	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	5-Me
9-183	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
9-184	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-185	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-186	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-187	1-環丙基乙基	Me	Ph	H
9-188	1-環丙基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-189	1-環丙基乙基	Me	2-噻吩基	H
9-190	1-環丙基乙基	Me	2-吡啶基	H
9-191	烯丙基	Me	Ph	H
9-192	烯丙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-193	烯丙基	Me	2-噻吩基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
9-194	烯丙基	Me	2-吡啶基	H
9-195	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H
9-196	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-197	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-198	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-199	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
9-200	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-201	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-202	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-203	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H
9-204	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-205	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-206	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-207	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
9-208	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-209	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-210	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-211	環丁基甲基	Me	Ph	H
9-212	環丁基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-213	環丁基甲基	Me	2-噻吩基	H
9-214	環丁基甲基	Me	2-吡啶基	H
9-215	環戊基甲基	Me	Ph	H
9-216	環戊基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-217	環戊基甲基	Me	2-噻吩基	H
9-218	環戊基甲基	Me	2-吡啶基	H
9-219	環己基甲基	Me	Ph	H
9-220	環己基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-221	環己基甲基	Me	2-噻吩基	H
9-222	環己基甲基	Me	2-吡啶基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
9-223	丁-3-烯-1-基	Me	Ph	H
9-224	丁-3-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-225	丁-3-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-226	丁-3-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-227	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
9-228	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-229	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
9-230	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	3-噻吩基	H
9-231	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
9-232	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
9-233	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
9-234	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
9-235	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	3-吡啶基	H
9-236	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
9-237	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
9-238	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-239	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-Ph	H
9-240	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Br-Ph	H
9-241	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-F-Ph	H
9-242	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-243	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-244	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-245	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-246	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
9-247	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-吡啶基	H
9-248	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
9-249	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	Ph	5-Me
9-250	2-氯丙-2-烯-1-基	H	Ph	H
9-251	2-甲氧基乙基	Me	Ph	H

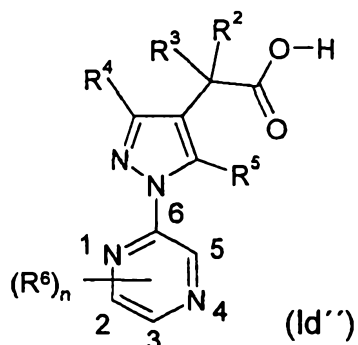
編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
9-252	2-甲氧基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-253	2-甲氧基乙基	Me	2-噻吩基	H
9-254	2-甲氧基乙基	Me	2-吡啶基	H
9-255	四氫呋喃-2-基甲基	Me	Ph	H
9-256	四氫呋喃-2-基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-257	四氫呋喃-2-基甲基	Me	2-噻吩基	H
9-258	四氫呋喃-2-基甲基	Me	2-吡啶基	H
9-259	2-(二甲基胺基)乙基	Me	Ph	H
9-260	2-(二甲基胺基)乙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-261	2-(二甲基胺基)乙基	Me	2-噻吩基	H
9-262	2-(二甲基胺基)乙基	Me	2-吡啶基	H
9-263	氧雜環丁烷-3-基	Me	Ph	H
9-264	氧雜環丁烷-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-265	氧雜環丁烷-3-基	Me	2-噻吩基	H
9-266	氧雜環丁烷-3-基	Me	2-吡啶基	H
9-267	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	Ph	H
9-268	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-269	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	2-噻吩基	H
9-270	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	2-吡啶基	H
9-271	2,2,2-三氟乙基	Me	Ph	H
9-272	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-273	2,2,2-三氟乙基	Me	2-噻吩基	H
9-274	2,2,2-三氟乙基	Me	3-吡啶基	H
9-275	2,2,2-三氟乙基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-276	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Me-Ph	H
9-277	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
9-278	2,2,2-三氟乙基	Me	4-F-Ph	H
9-279	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-280	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
9-281	2,2,2-三氟乙基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-282	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-283	2,2,2-三氟乙基	Me	2-吡啶基	H
9-284	2,2,2-三氟乙基	Me	4-吡啶基	H
9-285	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	Ph	H
9-286	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
9-287	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	2-噻吩基	H
9-288	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	3-吡啶基	H
9-289	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-290	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
9-291	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
9-292	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-F-Ph	H
9-293	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-294	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-295	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-296	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-297	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	2-吡啶基	H
9-298	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-吡啶基	H
9-299	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	Ph	H
9-300	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
9-301	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	2-噻吩基	H
9-302	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	3-吡啶基	H
9-303	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-304	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
9-305	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
9-306	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-F-Ph	H
9-307	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-308	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-309	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
9-310	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-311	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	2-吡啶基	H
9-312	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-吡啶基	H
9-313	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	Ph	H
9-314	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
9-315	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	2-噻吩基	H
9-316	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	3-吡啶基	H
9-317	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-318	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
9-319	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
9-320	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-F-Ph	H
9-321	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-322	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-323	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-324	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-325	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	2-吡啶基	H
9-326	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-吡啶基	H
9-327	2,2-二氟乙基	Me	Ph	H
9-328	2,2-二氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-329	2,2-二氟乙基	Me	2-噻吩基	H
9-330	2,2-二氟乙基	Me	2-吡啶基	H
9-331	Ph	Me	Ph	H
9-332	Ph	Me	4-Cl-Ph	H
9-333	Ph	Me	2-噻吩基	H
9-334	Ph	Me	2-吡啶基	H
9-335	2-氟乙基	Me	Ph	H
9-336	2-氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-337	2-氟乙基	Me	2-噻吩基	H
9-338	2-氟乙基	Me	2-吡啶基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
9-339	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	Ph	H
9-340	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
9-341	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-噻吩基	H
9-342	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-吡啶基	H
9-343	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	Ph	H
9-344	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	4-Cl-Ph	H
9-345	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	2-噻吩基	H
9-346	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	2-吡啶基	H
9-347	丁-3-炔-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
9-348	丁-3-炔-2-基	Me	異喹啉-3-基	H
9-349	丁-3-炔-2-基	Me	喹啉-2-基	H
9-350	丁-3-炔-2-基	Me	Ph	H
9-351	丁-3-炔-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
9-352	丁-3-炔-2-基	Me	2-噻吩基	H
9-353	丁-3-炔-2-基	Me	3-吡啶基	H
9-354	丁-3-炔-2-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
9-355	丁-3-炔-2-基	Me	4-Me-Ph	H
9-356	丁-3-炔-2-基	Me	4-Br-Ph	H
9-357	丁-3-炔-2-基	Me	4-F-Ph	H
9-358	丁-3-炔-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
9-359	丁-3-炔-2-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
9-360	丁-3-炔-2-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
9-361	丁-3-炔-2-基	Me	2-吡啶基	H
9-362	丁-3-炔-2-基	Me	4-吡啶基	H
9-363	Et	Me	異喹啉-3-基	H
9-364	Et	Me	喹啉-2-基	H

表 10： 式 (Id'') 所示化合物



編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
10-1	H	H	Ph	Ph	H
10-2	H	H	Me	Ph	H
10-3	H	H	Me	5-I-2-噻吩基	H
10-4	H	H	Me	2-呋喃基	H
10-5	H	H	Me	Ph	3-OMe
10-6	Me	H	Me	Ph	5-Me
10-7	H	H	Me	Ph	3-Cl
10-8	H	H	Me	Ph	5-CF <sub>3</sub>
10-9	H	H	Me	Ph	3-CF <sub>3</sub>
10-10	H	H	Me	Ph	5-Me
10-11	H	H	Me	Ph	3,5-Me <sub>2</sub>
10-12	H	H	Me	Ph	3,5-Cl <sub>2</sub>
10-13	H	H	Me	4-MeO-Ph	5-Me
10-14	H	H	Me	4-MeO-Ph	H
10-15	Me	H	Me	Ph	H
10-16	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me
10-17	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Cl
10-18	H	H	Me	4-Me-Ph	H
10-19	H	H	Me	3-Cl-Ph	H
10-20	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
10-21	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Me
10-22	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
10-23	H	H	Me	3-Cl-Ph	5-Me
10-24	H	H	Me	2-Cl-Ph	5-Me
10-25	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
10-26	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Me
10-27	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Me
10-28	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
10-29	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
10-30	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H
10-31	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Cl
10-32	H	H	Me	Ph	5-Cl
10-33	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
10-34	H	H	Me	4-tBu-Ph	5-Me
10-35	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	5-Me
10-36	H	H	Me	Ph	5-OMe
10-37	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-OMe
10-38	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me
10-39	H	H	Me	4-F-Ph	5-Cl
10-40	H	H	Me	4-F-Ph	5-Me
10-41	H	H	Me	3-Me-Ph	5-Me
10-42	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	5-Me
10-43	H	H	Me	3-Br-Ph	5-Me
10-44	H	H	Me	4-Ph-Ph	5-Me
10-45	H	H	Me	4-(COOH)-Ph	H
10-46	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	H
10-47	H	H	Me	Ph	5-SMe
10-48	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SMe
10-49	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
10-50	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	H
10-51	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	5-Me
10-52	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	5-Me
10-53	H	H	Me	2-吡啶基	5-Cl
10-54	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-F
10-55	H	H	Me	2-噻吩基	5-Me
10-56	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	5-Me
10-57	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	5-Me
10-58	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Me
10-59	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Cl
10-60	H	H	Me	3-噻吩基	5-Me
10-61	H	H	Me	2-噻吩基	H
10-62	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	H
10-63	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	H
10-64	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
10-65	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基	H
10-66	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
10-67	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	H
10-68	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	5-Me
10-69	H	H	Me	3-噻吩基	H
10-70	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-S(O)Me
10-71	H	H	Me	4-Br-Ph	5-Me
10-72	H	H	Me	1,3-苯並二噁茂-5-基	5-Me
10-73	H	H	Me	4-I-Ph	5-Me
10-74	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
10-75	H	H	Me	4-PhO-Ph	5-Me
10-76	H	H	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
10-77	H	H	Me	Ph	5-S(O)Me
10-78	H	H	H	Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
10-79	H	H	H	Ph	5-Me
10-80	H	H	Et	Ph	H
10-81	H	H	n-Pr	Ph	H
10-82	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	H
10-83	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	H
10-84	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	H
10-85	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	H
10-86	H	H	Cl	Ph	H
10-87	H	H	Et	Ph	5-Me
10-88	H	H	n-Pr	Ph	5-Me
10-89	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	5-Me
10-90	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	5-Me
10-91	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	5-Me
10-92	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	5-Me
10-93	H	H	Cl	Ph	5-Me
10-94	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
10-95	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
10-96	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Cl-Ph	H
10-97	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
10-98	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Cl-Ph	H
10-99	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
10-100	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
10-101	H	H	Et	4-Me-Ph	H
10-102	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H
10-103	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Me-Ph	H
10-104	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H
10-105	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Me-Ph	H
10-106	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H
10-107	H	H	Cl	4-Me-Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
10-108	H	H	Et	2-吡啶基	H
10-109	H	H	n-Pr	2-吡啶基	H
10-110	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	2-吡啶基	H
10-111	H	H	CHCl <sub>2</sub>	2-吡啶基	H
10-112	H	H	CH <sub>2</sub> F	2-吡啶基	H
10-113	H	H	CHF <sub>2</sub>	2-吡啶基	H
10-114	H	H	Cl	2-吡啶基	H
10-115	H	H	Me	2-吡啶基	H
10-116	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
10-117	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Cl
10-118	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Me
10-119	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
10-120	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Cl
10-121	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Me
10-122	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
10-123	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
10-124	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	5-Me
10-125	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
10-126	H	H	Me	4-CH <sub>2</sub> COOH-Ph	5-Me
10-127	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	5-Me
10-128	H	H	Me	4-Br-Ph	H
10-129	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	H
10-130	H	H	Me	3-Me-Ph	H
10-131	H	H	Me	4-F-Ph	H
10-132	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
10-133	H	H	Me	4-tBu-Ph	H
10-134	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
10-135	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	5-Me
10-136	H	H	Me	3-吡啶基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
10-137	H	H	Me	4-吡啶基	H
10-138	H	H	C(O)OMe	Ph	H
10-139	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
10-140	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SO <sub>2</sub> Me
10-141	H	H	Me	3-吡啶基	5-Me
10-142	H	H	Me	2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
10-143	H	H	Me	2-吡啶基	5-Me
10-144	H	H	H	4-Cl-Ph	5-Me
10-145	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
10-146	H	H	Me	Ph	3-Me
10-147	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
10-148	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Me
10-149	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Cl
10-150	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-F
10-151	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H
10-152	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H
10-153	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
10-154	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
10-155	H	H	Me	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基	H
10-156	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
10-157	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
10-158	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
10-159	H	H	CN	4-Cl-Ph	5-Me
10-160	H	H	CN	4-Me-Ph	H
10-161	H	H	CN	4-Me-Ph	5-Me
10-162	H	H	CN	Ph	H
10-163	H	H	CN	Ph	5-Me
10-164	H	H	CN	2-吡啶基	H
10-165	H	H	CN	3-吡啶基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
10-166	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H
10-167	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H
10-168	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
10-169	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H
10-170	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
10-171	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
10-172	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
10-173	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
10-174	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
10-175	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
10-176	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	H
10-177	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	5-Me
10-178	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	H
10-179	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	5-Me
10-180	H	H	甲醯基	Ph	H
10-181	H	H	甲醯基	Ph	5-Me
10-182	H	H	甲醯基	2-吡啶基	H
10-183	H	H	甲醯基	3-吡啶基	H
10-184	H	H	甲醯基	5-Cl-吡啶-2-基	H
10-185	H	H	甲醯基	5-Br-吡啶-2-基	H
10-186	H	H	甲醯基	5-F-吡啶-2-基	H
10-187	H	H	甲醯基	5-Me-吡啶-2-基	H
10-188	H	H	甲醯基	6-Me-吡啶-3-基	H
10-189	H	H	甲醯基	4-Me-吡啶-2-基	H
10-190	H	H	甲醯基	4-F-吡啶-2-基	H
10-191	H	H	甲醯基	4-Cl-吡啶-2-基	H
10-192	H	H	甲醯基	4-Br-吡啶-2-基	H
10-193	H	H	甲醯基	4-OMe-吡啶-2-基	H
10-194	H	H	CH <sub>2</sub> OH	5-Me-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
10-195	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Cl-Ph	H
10-196	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-吡啶-2-基	H
10-197	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-Ph	H
10-198	H	H	CH <sub>2</sub> OH	Ph	H
10-199	H	H	CH <sub>2</sub> OH	2-吡啶基	H
10-200	H	H	Me	2-噻唑基	H
10-201	H	H	Me	2-噻唑基	5-Cl
10-202	H	H	Me	2-噻唑基	5-Me
10-203	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
10-204	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Cl
10-205	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Me
10-206	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
10-207	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
10-208	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	5-Me
10-209	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
10-210	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
10-211	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	5-Me
10-212	H	H	Me	2-吡啶基	5-F
10-213	H	H	Me	2-吡嗪基	H
10-214	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
10-215	H	H	Me	2-吡嗪基	5-Me
10-216	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	H
10-217	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	5-Me
10-218	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
10-219	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	H
10-220	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	5-Me
10-221	H	H	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
10-222	H	H	Me	4,5-Cl <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
10-223	H	H	Me	2-嘧啶基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
10-224	H	H	Me	2-嘧啶基	5-Me
10-225	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
10-226	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
10-227	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
10-228	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
10-229	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	5-Me
10-230	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
10-231	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	5-Me
10-232	H	H	Me	3-噻嗪基	H
10-233	H	H	Me	6-Me-噻嗪-3-基	H
10-234	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基	H
10-235	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H
10-236	H	H	Me	4-Cl-Ph	2-OMe
10-237	Me	H	Me	2-吡啶基	2-OMe
10-238	Me	H	Me	4-Cl-Ph	2-OMe
10-239	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
10-240	H	H	Me	異喹啉-3-基	H
10-241	H	H	Me	喹啉-2-基	H

此外，測得本發明之通式(I)化合物的 NMR 數據。代表化合物的 NMR 分別以 400 MHz 之 <sup>1</sup>H-NMR 光譜的形式記錄(CDCl<sub>3</sub>) (<sup>1</sup>H 核磁共振數據)。部份例示化合物之特徵化學位移 δ (ppm)示於下文：

NMR 化合物 10-236 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz, δ ppm) :

2.39 (s, 3H) ; 3.23 (s, 3H) ; 3.39 (s, 2H) ; 7.24 (d, 2H)

; 7.38 (d, 2H) ; 8.01 (d, 1H) ; 8.63 (d, 1H) 。 m.p. :

169-171°C。

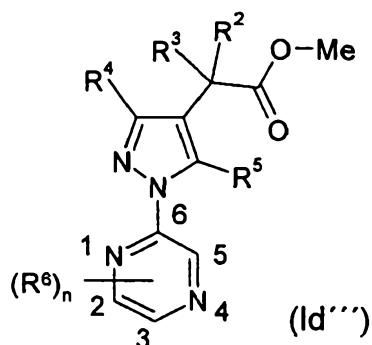
NMR 化合物 10-237 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz, δ ppm) :

1.51 (*d*, 3H) ; 2.49 (*s*, 3H) ; 3.29 (*s*, 3H) ; 3.72 (*q*, 1H)  
; 7.30 (*m*, 1H) ; 7.46 (*m*, 1H) ; 7.82 (*m*, 1H) ; 8.10 (*d*,  
1H) ; 8.64 (*d*, 1H) ; 8.70 (*m*, 1H) ; 14.32 (*brs*, 1H)。

NMR 化合物 10-238 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz, δ ppm) :

1.40 (*d*, 3H) ; 2.42 (*s*, 3H) ; 3.24 (*s*, 3H) ; 3.58 (*q*, 1H)  
; 7.25 (*d*, 2H) ; 7.38 (*d*, 2H) ; 7.98 (*d*, 1H) ; 8.62 (*d*,  
1H) 。 m.p. : 176-178°C。

表 11： 式 (Id''') 所示化合物



編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
11-1	H	H	Ph	Ph	H
11-2	H	H	Me	Ph	H
11-3	H	H	Me	5-I-2-噻吩基	H
11-4	H	H	Me	2-呋喃基	H
11-5	H	H	Me	Ph	3-OMe
11-6	Me	H	Me	Ph	5-Me
11-7	H	H	Me	Ph	3-Cl
11-8	H	H	Me	Ph	5-CF <sub>3</sub>
11-9	H	H	Me	Ph	3-CF <sub>3</sub>
11-10	H	H	Me	Ph	5-Me
11-11	H	H	Me	Ph	3,5-Me <sub>2</sub>
11-12	H	H	Me	Ph	3,5-Cl <sub>2</sub>
11-13	H	H	Me	4-MeO-Ph	5-Me
11-14	H	H	Me	4-MeO-Ph	H
11-15	Me	H	Me	Ph	H
11-16	H	H	Me	4-Me-Ph	H
11-17	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me
11-18	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Cl
11-19	H	H	Me	3-Cl-Ph	H
11-20	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
11-21	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Me
11-22	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
11-23	H	H	Me	3-Cl-Ph	5-Me
11-24	H	H	Me	2-Cl-Ph	5-Me
11-25	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
11-26	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	5-Me
11-27	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Me
11-28	H	H	Me	4-Cl-Ph	H
11-29	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
11-30	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H
11-31	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-Cl
11-32	H	H	Me	Ph	5-Cl
11-33	H	H	Me	2-Cl-Ph	H
11-34	H	H	Me	4-tBu-Ph	5-Me
11-35	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	5-Me
11-36	H	H	Me	Ph	5-OMe
11-37	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-OMe
11-38	H	H	Me	4-Me-Ph	5-Me
11-39	H	H	Me	4-F-Ph	5-Me
11-40	H	H	Me	4-F-Ph	5-Cl
11-41	H	H	Me	3-Me-Ph	5-Me
11-42	H	H	Me	4-COOH-Ph	5-Me
11-43	H	H	Me	3-Br-Ph	5-Me
11-44	H	H	Me	4-Ph-Ph	5-Me
11-45	H	H	Me	4-COOH-Ph	H
11-46	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph	H
11-47	H	H	Me	Ph	5-SMe
11-48	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SMe
11-49	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
11-50	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	H
11-51	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph	5-Me
11-52	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph	5-Me
11-53	H	H	Me	2-吡啶基	5-Cl
11-54	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-F
11-55	H	H	Me	2-噻吩基	5-Me
11-56	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	5-Me
11-57	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	5-Me
11-58	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Me
11-59	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Cl
11-60	H	H	Me	3-噻吩基	5-Me
11-61	H	H	Me	2-噻吩基	H
11-62	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基	H
11-63	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基	H
11-64	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
11-65	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基	H
11-66	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
11-67	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	H
11-68	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基	5-Me
11-69	H	H	Me	3-噻吩基	H
11-70	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-S(O)Me
11-71	H	H	Me	4-Br-Ph	5-Me
11-72	H	H	Me	1,3-苯並二噁茂-5-基	5-Me
11-73	H	H	Me	4-I-Ph	5-Me
11-74	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
11-75	H	H	Me	4-PhO-Ph	5-Me
11-76	H	H	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
11-77	H	H	Me	Ph	5-S(O)Me
11-78	H	H	H	Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
11-79	H	H	H	Ph	5-Me
11-80	H	H	Et	Ph	H
11-81	H	H	n-Pr	Ph	H
11-82	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	H
11-83	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	H
11-84	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	H
11-85	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	H
11-86	H	H	Cl	Ph	H
11-87	H	H	Et	Ph	5-Me
11-88	H	H	n-Pr	Ph	5-Me
11-89	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph	5-Me
11-90	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph	5-Me
11-91	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph	5-Me
11-92	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	5-Me
11-93	H	H	Cl	Ph	5-Me
11-94	H	H	Et	4-Cl-Ph	H
11-95	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	H
11-96	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Cl-Ph	H
11-97	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
11-98	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Cl-Ph	H
11-99	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Cl-Ph	H
11-100	H	H	Cl	4-Cl-Ph	H
11-101	H	H	Et	4-Me-Ph	H
11-102	H	H	n-Pr	4-Me-Ph	H
11-103	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Me-Ph	H
11-104	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H
11-105	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Me-Ph	H
11-106	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Me-Ph	H
11-107	H	H	Cl	4-Me-Ph	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
11-108	H	H	Et	2-吡啶基	H
11-109	H	H	n-Pr	2-吡啶基	H
11-110	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	2-吡啶基	H
11-111	H	H	CHCl <sub>2</sub>	2-吡啶基	H
11-112	H	H	CH <sub>2</sub> F	2-吡啶基	H
11-113	H	H	CHF <sub>2</sub>	2-吡啶基	H
11-114	H	H	Cl	2-吡啶基	H
11-115	H	H	Me	2-吡啶基	H
11-116	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
11-117	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Cl
11-118	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Me
11-119	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
11-120	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Cl
11-121	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Me
11-122	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基	H
11-123	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
11-124	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基	5-Me
11-125	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
11-126	H	H	Me	4-(CH <sub>2</sub> COOH)-Ph	5-Me
11-127	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	5-Me
11-128	H	H	Me	4-Br-Ph	5-Me
11-129	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph	H
11-130	H	H	Me	3-Me-Ph	H
11-131	H	H	Me	4-F-Ph	H
11-132	H	H	Me	4-(Me-CO)-Ph	H
11-133	H	H	Me	4-tBu-Ph	H
11-134	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph	H
11-135	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph	5-Me
11-136	H	H	Me	3-吡啶基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
11-137	H	H	Me	4-吡啶基	H
11-138	H	H	C(O)OMe	Ph	H
11-139	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
11-140	H	H	Me	4-Cl-Ph	5-SO <sub>2</sub> Me
11-141	H	H	Me	3-吡啶基	5-Me
11-142	H	H	Me	2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph	5-Me
11-143	H	H	Me	2-吡啶基	5-Me
11-144	H	H	H	4-Cl-Ph	5-Me
11-145	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基	H
11-146	H	H	Me	Ph	5-Me
11-147	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
11-148	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Me
11-149	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Cl
11-150	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-F
11-151	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基	H
11-152	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基	H
11-153	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基	H
11-154	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基	H
11-155	H	H	Me	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基	H
11-156	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基	H
11-157	H	H	cyPr	4-Cl-Ph	H
11-158	H	H	CN	4-Cl-Ph	H
11-159	H	H	CN	4-Cl-Ph	5-Me
11-160	H	H	CN	4-Me-Ph	H
11-161	H	H	CN	4-Me-Ph	5-Me
11-162	H	H	CN	Ph	H
11-163	H	H	CN	Ph	5-Me
11-164	H	H	CN	2-吡啶基	H
11-165	H	H	CN	3-吡啶基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
11-166	H	H	CN	5-Cl-吡啶-2-基	H
11-167	H	H	CN	5-Br-吡啶-2-基	H
11-168	H	H	CN	5-F-吡啶-2-基	H
11-169	H	H	CN	5-Me-吡啶-2-基	H
11-170	H	H	CN	6-Me-吡啶-3-基	H
11-171	H	H	CN	4-Me-吡啶-2-基	H
11-172	H	H	CN	4-F-吡啶-2-基	H
11-173	H	H	CN	4-Cl-吡啶-2-基	H
11-174	H	H	CN	4-Br-吡啶-2-基	H
11-175	H	H	CN	4-OMe-吡啶-2-基	H
11-176	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	H
11-177	H	H	甲醯基	4-Cl-Ph	5-Me
11-178	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	H
11-179	H	H	甲醯基	4-Me-Ph	5-Me
11-180	H	H	甲醯基	Ph	H
11-181	H	H	甲醯基	Ph	5-Me
11-182	H	H	甲醯基	2-吡啶基	H
11-183	H	H	甲醯基	3-吡啶基	H
11-184	H	H	甲醯基	5-Cl-吡啶-2-基	H
11-185	H	H	甲醯基	5-Br-吡啶-2-基	H
11-186	H	H	甲醯基	5-F-吡啶-2-基	H
11-187	H	H	甲醯基	5-Me-吡啶-2-基	H
11-188	H	H	甲醯基	6-Me-吡啶-3-基	H
11-189	H	H	甲醯基	4-Me-吡啶-2-基	H
11-190	H	H	甲醯基	4-F-吡啶-2-基	H
11-191	H	H	甲醯基	4-Cl-吡啶-2-基	H
11-192	H	H	甲醯基	4-Br-吡啶-2-基	H
11-193	H	H	甲醯基	4-OMe-吡啶-2-基	H
11-194	H	H	CH <sub>2</sub> OH	5-Me-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
11-195	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Cl-Ph	H
11-196	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-吡啶-2-基	H
11-197	H	H	CH <sub>2</sub> OH	4-Me-Ph	H
11-198	H	H	CH <sub>2</sub> OH	Ph	H
11-199	H	H	CH <sub>2</sub> OH	2-吡啶基	H
11-200	H	H	Me	2-噻唑基	H
11-201	H	H	Me	2-噻唑基	5-Cl
11-202	H	H	Me	2-噻唑基	5-Me
11-203	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
11-204	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Cl
11-205	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基	5-Me
11-206	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
11-207	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
11-208	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基	5-Me
11-209	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
11-210	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
11-211	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	5-Me
11-212	H	H	Me	2-吡啶基	5-F
11-213	H	H	Me	2-吡嗪基	H
11-214	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
11-215	H	H	Me	2-吡嗪基	5-Me
11-216	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	H
11-217	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	5-Me
11-218	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
11-219	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	H
11-220	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	5-Me
11-221	H	H	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
11-222	H	H	Me	4,5-Cl <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
11-223	H	H	Me	2-嘧啶基	H

編號	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
11-224	H	H	Me	2-嘧啶基	5-Me
11-225	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
11-226	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H
11-227	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
11-228	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
11-229	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基	5-Me
11-230	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
11-231	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	5-Me
11-232	H	H	Me	3-噻嗪基	H
11-233	H	H	Me	6-Me-噻嗪-3-基	H
11-234	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基	H
11-235	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H
11-236	Me	H	Me	2-吡啶基	2-Cl
11-237	H	H	Me	4-Cl-Ph	2-Cl
11-238	Me	H	Me	4-Cl-Ph	2-Cl
11-239	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph	H
11-240	H	H	Me	異喹啉-3-基	H
11-241	H	H	Me	喹啉-2-基	H

此外，測得本發明之通式(I)化合物的 NMR 數據。代表化合物的 NMR 分別以 400 MHz 之 <sup>1</sup>H-NMR 光譜的形式記錄(CDCl<sub>3</sub>) (<sup>1</sup>H 核磁共振數據)。部份例示化合物之特徵化學位移 δ (ppm)示於下文：

NMR 化合物 11-236 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz, δ ppm) :

1.42 (*d*, 3H) ; 2.39 (*s*, 3H) ; 3.65 (*s*, 3H) ; 3.72 (*q*, 1H)  
; 7.35 (*m*, 1H) ; 7.44 (*m*, 1H) ; 7.80 (*m*, 1H) ; 8.31 (*m*

, 1H); 8.61 (*m*, 1H); 8.98 (*m*, 1H)。

NMR 化合物 11-28 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.37 (*s*, 3H); 3.38 (*s*, 2H); 3.70 (*s*, 3H); 7.20 (*d*, 2H)  
; 7.36 (*d*, 2H); 8.17 (*dd*, 1H); 8.38 (*d*, 1H); 8.86 (*d*  
, 1H)。

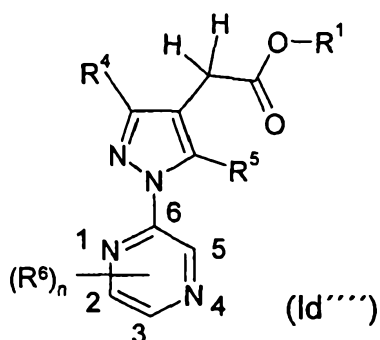
NMR 化合物 11-237 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

2.36 (*s*, 3H); 3.36 (*s*, 2H); 3.69 (*s*, 3H); 7.22 (*d*, 2H)  
; 7.39 (*d*, 2H); 8.34 (*d*, 1H); 8.85 (*d*, 1H)。m.p.:  
126-128°C。

NMR 化合物 11-238 (CDCl<sub>3</sub>, 400 MHz,  $\delta$  ppm):

1.40 (*d*, 3H); 2.37 (*s*, 3H); 3.56 (*q*, 1H); 3.68 (*s*, 3H)  
; 7.22 (*d*, 2H); 7.40 (*d*, 2H); 8.33 (*d*, 1H); 8.82 (*d*,  
1H)。

表 12： 式 (Id''''') 所示化合物



編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
12-1	Et	Me	Ph	H
12-2	Et	Me	Ph	5-Me
12-3	Et	Me	3-Cl-Ph	H
12-4	Et	Me	4-Cl-Ph	H
12-5	Et	Me	4-Cl-Ph	5-Me
12-6	Et	Me	2-噻吩基	H
12-7	Et	Me	3-噻吩基	H
12-8	Et	Me	3-Me-2-噻吩基	H
12-9	Et	Me	4-Me-2-噻吩基	H
12-10	Et	Me	5-Br-2-噻吩基	H
12-11	Et	Me	5-Br-2-噻吩基	5-Me
12-12	Et	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
12-13	Et	Me	5-Cl-2-噻吩基	5-Me
12-14	Et	Me	5-I-2-噻吩基	H
12-15	Et	Me	5-Me-2-噻吩基	H
12-16	Et	Me	3-吡啶基	H
12-17	Et	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
12-18	Et	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
12-19	Et	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-20	Et	Me	4-Me-Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
12-21	Et	Me	4-Me-Ph	5-Me
12-22	Et	Me	4-Br-Ph	H
12-23	Et	Me	4-F-Ph	H
12-24	Et	Me	4-F-Ph	5-Me
12-25	Et	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-26	Et	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-27	Et	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-28	Et	Me	5-F-吡啶-2-基	5-Me
12-29	Et	Me	5-Cl-吡啶-2-基	5-Me
12-30	Et	Me	5-Br-吡啶-2-基	5-Me
12-31	Et	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-32	Et	Me	5-Me-吡啶-2-基	5-Me
12-33	Et	Me	2-吡啶基	5-Me
12-34	Et	Me	2-吡啶基	H
12-35	Et	Me	4-吡啶基	H
12-36	Et	Me	4-Me-吡啶-2-基	H
12-37	Et	Me	4-Me-吡啶-2-基	5-Me
12-38	Et	Me	2-噻唑基	H
12-39	Et	Me	4-Me-噻唑-2-基	H
12-40	Et	Me	5-Br-噻唑-2-基	H
12-41	Et	Me	5-Cl-噻唑-2-基	H
12-42	Et	Me	5-Me-噻唑-2-基	H
12-43	Et	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
12-44	Et	Me	4,5-Cl <sub>2</sub> -噻唑-2-基	H
12-45	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基	H
12-46	Et	Me	2-吡嗪基	H
12-47	Et	Me	2-嘧啶基	H
12-48	Et	Me	2-嘧啶基	5-Me
12-49	Et	Me	5-Cl-嘧啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
12-50	Et	Me	5-Br-嘧啶-2-基	H
12-51	Et	Me	5-Me-嘧啶-2-基	H
12-52	Et	Me	5-Me-嘧啶-2-基	5-Me
12-53	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
12-54	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	5-Me
12-55	Et	Me	1,3-苯並噻唑-2-基	H
12-56	Et	Me	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基	H
12-57	Et	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基	H
12-58	Et	Me	5-Me-吡嗪-2-基	H
12-59	Et	Me	5-F-嘧啶-2-基	H
12-60	Et	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基	H
12-61	Et	Me	3-噻嗪基	H
12-62	Et	Me	6-Me-噻嗪-3-基	H
12-63	Et	Me	1,2,4-三嗪-3-基	H
12-64	Et	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基	H
12-65	Pr	Me	Ph	H
12-66	Pr	Me	4-Cl-Ph	H
12-67	Pr	Me	2-噻吩基	H
12-68	Pr	Me	3-吡啶基	H
12-69	Pr	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-70	Pr	Me	4-Me-Ph	H
12-71	Pr	Me	4-Br-Ph	H
12-72	Pr	Me	4-F-Ph	H
12-73	Pr	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-74	Pr	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-75	Pr	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-76	Pr	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-77	Pr	Me	2-吡啶基	H
12-78	Pr	Me	4-吡啶基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
12-79	i-Pr	Me	Ph	H
12-80	i-Pr	Me	4-Cl-Ph	H
12-81	i-Pr	Me	2-噻吩基	H
12-82	i-Pr	Me	3-吡啶基	H
12-83	i-Pr	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-84	i-Pr	Me	4-Me-Ph	H
12-85	i-Pr	Me	4-Br-Ph	H
12-86	i-Pr	Me	4-F-Ph	H
12-87	i-Pr	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-88	i-Pr	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-89	i-Pr	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-90	i-Pr	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-91	i-Pr	Me	2-吡啶基	H
12-92	i-Pr	Me	4-吡啶基	H
12-93	CH <sub>2</sub> Ph	Me	Ph	H
12-94	CH <sub>2</sub> Ph	Me	4-Cl-Ph	H
12-95	CH <sub>2</sub> Ph	Me	2-噻吩基	H
12-96	CH <sub>2</sub> Ph	Me	2-吡啶基	H
12-97	丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
12-98	丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-99	丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-100	丙-2-炔-1-基	Me	3-噻吩基	H
12-101	丙-2-炔-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
12-102	丙-2-炔-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
12-103	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
12-104	丙-2-炔-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
12-105	丙-2-炔-1-基	Me	3-吡啶基	H
12-106	丙-2-炔-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
12-107	丙-2-炔-1-基	H	Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
12-108	丙-2-炔-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-109	丙-2-炔-1-基	Me	4-Me-Ph	H
12-110	丙-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
12-111	丙-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
12-112	丙-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-113	丙-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-114	丙-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-115	丙-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-116	丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-117	丙-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
12-118	丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
12-119	丙-2-炔-1-基	Me	Ph	5-Me
12-120	環丙基甲基	Me	Ph	H
12-121	環丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-122	環丙基甲基	Me	2-噻吩基	H
12-123	環丙基甲基	Me	3-噻吩基	H
12-124	環丙基甲基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
12-125	環丙基甲基	Me	3-吡啶基	H
12-126	環丙基甲基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
12-127	環丙基甲基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
12-128	環丙基甲基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
12-129	環丙基甲基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
12-130	環丙基甲基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
12-131	環丙基甲基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-132	環丙基甲基	Me	4-Me-Ph	H
12-133	環丙基甲基	Me	4-Br-Ph	H
12-134	環丙基甲基	Me	4-F-Ph	H
12-135	環丙基甲基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-136	環丙基甲基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
12-137	環丙基甲基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-138	環丙基甲基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-139	環丙基甲基	Me	2-吡啶基	H
12-140	環丙基甲基	Me	4-吡啶基	H
12-141	環丙基甲基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
12-142	環丙基甲基	Me	Ph	5-Me
12-143	環丙基甲基	H	Ph	H
12-144	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
12-145	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-146	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-147	3,3-二氯-2-氟丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-148	(1-甲基環丙基)甲基	Me	Ph	H
12-149	(1-甲基環丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-150	(1-甲基環丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H
12-151	(1-甲基環丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H
12-152	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
12-153	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-154	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-155	4-氯丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-156	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	Ph	H
12-157	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-158	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	2-噻吩基	H
12-159	(2,2-二氯環丙基)甲基	Me	2-吡啶基	H
12-160	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	H
12-161	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-162	丁-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-163	丁-2-炔-1-基	Me	3-噻吩基	H
12-164	丁-2-炔-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
12-165	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
12-166	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
12-167	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
12-168	丁-2-炔-1-基	Me	3-吡啶基	H
12-169	丁-2-炔-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
12-170	丁-2-炔-1-基	H	Ph	H
12-171	丁-2-炔-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-172	丁-2-炔-1-基	Me	4-Me-Ph	H
12-173	丁-2-炔-1-基	Me	4-Br-Ph	H
12-174	丁-2-炔-1-基	Me	4-F-Ph	H
12-175	丁-2-炔-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-176	丁-2-炔-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-177	丁-2-炔-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-178	丁-2-炔-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-179	丁-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-180	丁-2-炔-1-基	Me	4-吡啶基	H
12-181	丁-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
12-182	丁-2-炔-1-基	Me	Ph	5-Me
12-183	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
12-184	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-185	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-186	1-甲基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-187	1-環丙基乙基	Me	Ph	H
12-188	1-環丙基乙基	Me	4-Cl-Ph	H
12-189	1-環丙基乙基	Me	2-噻吩基	H
12-190	1-環丙基乙基	Me	2-吡啶基	H
12-191	烯丙基	Me	Ph	H
12-192	烯丙基	Me	4-Cl-Ph	H
12-193	烯丙基	Me	2-噻吩基	H
12-194	烯丙基	Me	2-吡啶基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
12-195	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H
12-196	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-197	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-198	3-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-199	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
12-200	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-201	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-202	2-甲基丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-203	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	Ph	H
12-204	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-205	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-206	(2E)-1-甲基丁-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-207	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	Ph	H
12-208	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-209	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-210	3-苯基丙-2-炔-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-211	環丁基甲基	Me	Ph	H
12-212	環丁基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-213	環丁基甲基	Me	2-噻吩基	H
12-214	環丁基甲基	Me	2-吡啶基	H
12-215	環戊基甲基	Me	Ph	H
12-216	環戊基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-217	環戊基甲基	Me	2-噻吩基	H
12-218	環戊基甲基	Me	2-吡啶基	H
12-219	環己基甲基	Me	Ph	H
12-220	環己基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-221	環己基甲基	Me	2-噻吩基	H
12-222	環己基甲基	Me	2-吡啶基	H
12-223	丁-3-烯-1-基	Me	Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
12-224	丁-3-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-225	丁-3-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-226	丁-3-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-227	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	Ph	H
12-228	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-229	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	2-噻吩基	H
12-230	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	3-噻吩基	H
12-231	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	3-Me-2-噻吩基	H
12-232	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-2-噻吩基	H
12-233	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-2-噻吩基	H
12-234	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-2-噻吩基	H
12-235	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	3-吡啶基	H
12-236	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	6-MeO-吡啶-3-基	H
12-237	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	6-OH-吡啶-3-基	H
12-238	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-239	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Me-Ph	H
12-240	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Br-Ph	H
12-241	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-F-Ph	H
12-242	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-243	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-244	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-245	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-246	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	2-吡啶基	H
12-247	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-吡啶基	H
12-248	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	4-Cl-Ph	5-Me
12-249	2-氯丙-2-烯-1-基	Me	Ph	5-Me
12-250	2-氯丙-2-烯-1-基	H	Ph	H
12-251	2-甲氧基乙基	Me	Ph	H
12-252	2-甲氧基乙基	Me	4-Cl-Ph	H

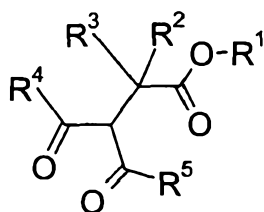
編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
12-253	2-甲氧基乙基	Me	2-噻吩基	H
12-254	2-甲氧基乙基	Me	2-吡啶基	H
12-255	四氫呋喃-2-基甲基	Me	Ph	H
12-256	四氫呋喃-2-基甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-257	四氫呋喃-2-基甲基	Me	2-噻吩基	H
12-258	四氫呋喃-2-基甲基	Me	2-吡啶基	H
12-259	2-(二甲基氨基)乙基	Me	Ph	H
12-260	2-(二甲基氨基)乙基	Me	4-Cl-Ph	H
12-261	2-(二甲基氨基)乙基	Me	2-噻吩基	H
12-262	2-(二甲基氨基)乙基	Me	2-吡啶基	H
12-263	氧雜環丁烷-3-基	Me	Ph	H
12-264	氧雜環丁烷-3-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-265	氧雜環丁烷-3-基	Me	2-噻吩基	H
12-266	氧雜環丁烷-3-基	Me	2-吡啶基	H
12-267	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	Ph	H
12-268	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-269	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	2-噻吩基	H
12-270	(3-甲基氧雜環丁烷-3-基)甲基	Me	2-吡啶基	H
12-271	2,2,2-三氟乙基	Me	Ph	H
12-272	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
12-273	2,2,2-三氟乙基	Me	2-噻吩基	H
12-274	2,2,2-三氟乙基	Me	3-吡啶基	H
12-275	2,2,2-三氟乙基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-276	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Me-Ph	H
12-277	2,2,2-三氟乙基	Me	4-Br-Ph	H
12-278	2,2,2-三氟乙基	Me	4-F-Ph	H
12-279	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-280	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-281	2,2,2-三氟乙基	Me	5-F-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
12-282	2,2,2-三氟乙基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-283	2,2,2-三氟乙基	Me	2-吡啶基	H
12-284	2,2,2-三氟乙基	Me	4-吡啶基	H
12-285	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	Ph	H
12-286	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
12-287	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	2-噻吩基	H
12-288	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	3-吡啶基	H
12-289	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-290	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
12-291	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
12-292	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-F-Ph	H
12-293	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-294	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-295	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-296	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-297	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	2-吡啶基	H
12-298	CH <sub>2</sub> (4-Cl-Ph)	Me	4-吡啶基	H
12-299	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	Ph	H
12-300	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
12-301	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	2-噻吩基	H
12-302	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	3-吡啶基	H
12-303	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-304	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
12-305	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
12-306	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-F-Ph	H
12-307	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-308	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-309	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-310	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
12-311	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	2-吡啶基	H
12-312	CH <sub>2</sub> (4-F-Ph)	Me	4-吡啶基	H
12-313	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	Ph	H
12-314	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-Cl-Ph	H
12-315	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	2-噻吩基	H
12-316	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	3-吡啶基	H
12-317	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-318	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-Me-Ph	H
12-319	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-Br-Ph	H
12-320	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-F-Ph	H
12-321	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-322	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-323	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-324	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-325	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	2-吡啶基	H
12-326	CH <sub>2</sub> (4-OMe-Ph)	Me	4-吡啶基	H
12-327	2,2-二氟乙基	Me	Ph	H
12-328	2,2-二氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
12-329	2,2-二氟乙基	Me	2-噻吩基	H
12-330	2,2-二氟乙基	Me	2-吡啶基	H
12-331	Ph	Me	Ph	H
12-332	Ph	Me	4-Cl-Ph	H
12-333	Ph	Me	2-噻吩基	H
12-334	Ph	Me	2-吡啶基	H
12-335	2-氟乙基	Me	Ph	H
12-336	2-氟乙基	Me	4-Cl-Ph	H
12-337	2-氟乙基	Me	2-噻吩基	H
12-338	2-氟乙基	Me	2-吡啶基	H
12-339	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	Ph	H

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>	(R <sup>6</sup> ) <sub>n</sub>
12-340	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	4-Cl-Ph	H
12-341	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-噻吩基	H
12-342	2,2,3,3,3-五氟丙基	Me	2-吡啶基	H
12-343	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	Ph	H
12-344	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	4-Cl-Ph	H
12-345	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	2-噻吩基	H
12-346	1-乙基-5-甲基-1H-吡啶-4-甲基	Me	2-吡啶基	H
12-347	丁-3-炔-2-基	Me	5-Cl-吡啶-2-基	H
12-348	丁-3-炔-2-基	Me	異喹啉-3-基	H
12-349	丁-3-炔-2-基	Me	喹啉-2-基	H
12-350	丁-3-炔-2-基	Me	Ph	H
12-351	丁-3-炔-2-基	Me	4-Cl-Ph	H
12-352	丁-3-炔-2-基	Me	2-噻吩基	H
12-353	丁-3-炔-2-基	Me	3-吡啶基	H
12-354	丁-3-炔-2-基	Me	6-Me-吡啶-3-基	H
12-355	丁-3-炔-2-基	Me	4-Me-Ph	H
12-356	丁-3-炔-2-基	Me	4-Br-Ph	H
12-357	丁-3-炔-2-基	Me	4-F-Ph	H
12-358	丁-3-炔-2-基	Me	5-Br-吡啶-2-基	H
12-359	丁-3-炔-2-基	Me	5-F-吡啶-2-基	H
12-360	丁-3-炔-2-基	Me	5-Me-吡啶-2-基	H
12-361	丁-3-炔-2-基	Me	2-吡啶基	H
12-362	丁-3-炔-2-基	Me	4-吡啶基	H
12-363	Et	Me	異喹啉-3-基	H
12-364	Et	Me	喹啉-2-基	H

表 13： 式 (III) 所示化合物 (中間物)



(III)

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
13-1	Me	H	H	Ph	Ph
13-2	Me	H	H	Me	Ph
13-3	Me	H	H	Me	2-呋喃基
13-4	Me	Me	H	Me	Ph
13-5	Me	H	H	Me	4-MeO-Ph
13-6	Me	H	H	Me	4-Me-Ph
13-7	Me	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph
13-8	Me	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph
13-9	Me	H	H	Me	3-Cl-Ph
13-10	Me	H	H	Me	2-Cl-Ph
13-11	Me	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph
13-12	Me	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph
13-13	Me	H	H	Me	4-Cl-Ph
13-14	Me	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph
13-15	Me	H	H	Me	4-tBu-Ph
13-16	Me	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph
13-17	Me	H	H	Me	4-Me-Ph
13-18	Me	H	H	Me	4-F-Ph
13-19	Me	H	H	Me	3-Me-Ph
13-20	Me	H	H	Me	4-COOH-Ph
13-21	Me	H	H	Me	3-Br-Ph
13-22	Me	H	H	Me	4-Ph-Ph

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
13-23	Me	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph
13-24	Me	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph
13-25	Me	H	H	Me	2-噻吩基
13-26	Me	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基
13-27	Me	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基
13-28	Me	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基
13-29	Me	H	H	Me	5-I-2-噻吩基
13-30	Me	H	H	Me	3-噻吩基
13-31	Me	H	H	Me	3-吡啶基
13-32	Me	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基
13-33	Me	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基
13-34	Me	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基
13-35	Me	H	H	Me	4-Br-Ph
13-36	Me	H	H	Me	1,3-苯並二噁茂-5-基
13-37	Me	H	H	Me	4-I-Ph
13-38	Me	H	H	Me	4-PhO-Ph
13-39	Me	H	H	Me	6-OH-吡啶-3-基
13-40	Me	H	H	H	Ph
13-41	Me	H	H	Et	Ph
13-42	Me	H	H	n-Pr	Ph
13-43	Me	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph
13-44	Me	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph
13-45	Me	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph
13-46	Me	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph
13-47	Me	H	H	Cl	Ph
13-48	Me	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph
13-49	Me	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Cl-Ph
13-50	Me	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Cl-Ph
13-51	Me	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Cl-Ph

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
13-52	Me	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Cl-Ph
13-53	Me	H	H	Cl	4-Cl-Ph
13-54	Me	H	H	Et	4-Me-Ph
13-55	Me	H	H	n-Pr	4-Me-Ph
13-56	Me	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Me-Ph
13-57	Me	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Me-Ph
13-58	Me	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Me-Ph
13-59	Me	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Me-Ph
13-60	Me	H	H	Cl	4-Me-Ph
13-61	Me	H	H	Et	2-吡啶基
13-62	Me	H	H	n-Pr	2-吡啶基
13-63	Me	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	2-吡啶基
13-64	Me	H	H	CHCl <sub>2</sub>	2-吡啶基
13-65	Me	H	H	CH <sub>2</sub> F	2-吡啶基
13-66	Me	H	H	CHF <sub>2</sub>	2-吡啶基
13-67	Me	H	H	Cl	2-吡啶基
13-68	Me	H	H	Me	2-吡啶基
13-69	Me	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基
13-70	Me	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基
13-71	Me	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基
13-72	Me	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基
13-73	Me	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基
13-74	Me	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph
13-75	Me	H	H	Me	4-CH <sub>2</sub> COOH-Ph
13-76	Me	H	H	Me	4-(MeCO)-Ph
13-77	Me	H	H	Me	4-tBu-Ph
13-78	Me	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph
13-79	Me	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph
13-80	Me	H	H	Me	3-吡啶基

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
13-81	Me	H	H	Me	4-吡啶基
13-82	Me	H	H	C(O)OMe	Ph
13-83	Me	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基
13-84	Me	H	H	Me	2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph
13-85	Me	H	H	H	4-Cl-Ph
13-86	Me	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基
13-87	Me	H	H	Me	2-噻唑基
13-88	Me	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基
13-89	Me	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基
13-90	Me	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基
13-91	Me	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基
13-92	Me	H	H	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -噻唑-2-基
13-93	Me	H	H	Me	4,5-Cl <sub>2</sub> -噻唑-2-基
13-94	Me	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基
13-95	Me	H	H	Me	2-吡嗪基
13-96	Me	H	H	Me	2-嘧啶基
13-97	Me	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基
13-98	Me	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基
13-99	Me	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基
13-100	Me	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基
13-101	Me	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基
13-102	Me	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基
13-103	Me	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡啶-3-基
13-104	Me	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基
13-105	Me	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基
13-106	Me	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基
13-107	Me	H	H	Me	3-噁嗪基
13-108	Me	H	H	Me	6-Me-噁嗪-3-基
13-109	Me	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
13-110	Me	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基
13-111	Et	H	H	Ph	Ph
13-112	Et	H	H	Me	Ph
13-113	Et	H	H	Me	2-呋喃基
13-114	Et	Me	H	Me	Ph
13-115	Et	H	H	Me	4-MeO-Ph
13-116	Et	H	H	Me	4-Me-Ph
13-117	Et	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -Ph
13-118	Et	H	H	Me	3,4-Cl <sub>2</sub> -Ph
13-119	Et	H	H	Me	3-Cl-Ph
13-120	Et	H	H	Me	2-Cl-Ph
13-121	Et	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph
13-122	Et	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph
13-123	Et	H	H	Me	4-Cl-Ph
13-124	Et	H	H	Me	4-CF <sub>3</sub> -Ph
13-125	Et	H	H	Me	4-tBu-Ph
13-126	Et	H	H	Me	3,5-Me <sub>2</sub> -Ph
13-127	Et	H	H	Me	4-Me-Ph
13-128	Et	H	H	Me	4-F-Ph
13-129	Et	H	H	Me	3-Me-Ph
13-130	Et	H	H	Me	4-COOH-Ph
13-131	Et	H	H	Me	3-Br-Ph
13-132	Et	H	H	Me	4-Ph-Ph
13-133	Et	H	H	Me	3-Cl-4-Me-Ph
13-134	Et	H	H	Me	3-CF <sub>3</sub> -4-Cl-Ph
13-135	Et	H	H	Me	2-噻吩基
13-136	Et	H	H	Me	3-Me-2-噻吩基
13-137	Et	H	H	Me	4-Me-2-噻吩基
13-138	Et	H	H	Me	5-Cl-2-噻吩基

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
13-139	Et	H	H	Me	5-I-2-噻吩基
13-140	Et	H	H	Me	3-噻吩基
13-141	Et	H	H	Me	3-吡啶基
13-142	Et	H	H	Me	5-Me-2-噻吩基
13-143	Et	H	H	Me	6-MeO-吡啶-3-基
13-144	Et	H	H	Me	5-Br-2-噻吩基
13-145	Et	H	H	Me	4-Br-Ph
13-146	Et	H	H	Me	1,3-苯並二噁茂-5-基
13-147	Et	H	H	Me	4-I-Ph
13-148	Et	H	H	Me	4-PhO-Ph
13-149	Et	H	H	Me	6-OH-吡啶-3-基
13-150	Et	H	H	H	Ph
13-151	Et	H	H	Et	Ph
13-152	Et	H	H	n-Pr	Ph
13-153	Et	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	Ph
13-154	Et	H	H	CHCl <sub>2</sub>	Ph
13-155	Et	H	H	CH <sub>2</sub> F	Ph
13-156	Et	H	H	CHF <sub>2</sub>	Ph
13-157	Et	H	H	Cl	Ph
13-158	Et	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph
13-159	Et	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Cl-Ph
13-160	Et	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Cl-Ph
13-161	Et	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Cl-Ph
13-162	Et	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Cl-Ph
13-163	Et	H	H	Cl	4-Cl-Ph
13-164	Et	H	H	Et	4-Me-Ph
13-165	Et	H	H	n-Pr	4-Me-Ph
13-166	Et	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	4-Me-Ph
13-167	Et	H	H	CHCl <sub>2</sub>	4-Me-Ph

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
13-168	Et	H	H	CH <sub>2</sub> F	4-Me-Ph
13-169	Et	H	H	CHF <sub>2</sub>	4-Me-Ph
13-170	Et	H	H	Cl	4-Me-Ph
13-171	Et	H	H	Et	2-吡啶基
13-172	Et	H	H	n-Pr	2-吡啶基
13-173	Et	H	H	CH <sub>2</sub> Cl	2-吡啶基
13-174	Et	H	H	CHCl <sub>2</sub>	2-吡啶基
13-175	Et	H	H	CH <sub>2</sub> F	2-吡啶基
13-176	Et	H	H	CHF <sub>2</sub>	2-吡啶基
13-177	Et	H	H	Cl	2-吡啶基
13-178	Et	H	H	Me	2-吡啶基
13-179	Et	H	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基
13-180	Et	H	H	Me	5-Br-吡啶-2-基
13-181	Et	H	H	Me	5-F-吡啶-2-基
13-182	Et	H	H	Me	5-Me-吡啶-2-基
13-183	Et	H	H	Me	4-Me-吡啶-2-基
13-184	Et	H	H	Me	2,4-Cl <sub>2</sub> -Ph
13-185	Et	H	H	Me	4-CH <sub>2</sub> COOH-Ph
13-186	Et	H	H	Me	4-(MeCO)-Ph
13-187	Et	H	H	Me	4-tBu-Ph
13-188	Et	H	H	Me	4-Cl-3-Me-Ph
13-189	Et	H	H	n-Pr	4-Cl-Ph
13-190	Et	H	H	Me	3-吡啶基
13-191	Et	H	H	Me	4-吡啶基
13-192	Et	H	H	C(O)OMe	Ph
13-193	Et	H	H	Me	6-Me-吡啶-3-基
13-194	Et	H	H	Me	2,3-Cl <sub>2</sub> -Ph
13-195	Et	H	H	H	4-Cl-Ph
13-196	Et	H	H	Me	6-Cl-吡啶-3-基

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
13-197	Et	H	H	Me	2-噻唑基
13-198	Et	H	H	Me	4-Me-噻唑-2-基
13-199	Et	H	H	Me	5-Br-噻唑-2-基
13-200	Et	H	H	Me	5-Cl-噻唑-2-基
13-201	Et	H	H	Me	5-Me-噻唑-2-基
13-202	Et	H	H	Me	4,5-Me <sub>2</sub> -噻唑-2-基
13-203	Et	H	H	Me	4,5-Cl <sub>2</sub> -噻唑-2-基
13-204	Et	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -吡啶-2-基
13-205	Et	H	H	Me	2-吡嗪基
13-206	Et	H	H	Me	2-嘧啶基
13-207	Et	H	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基
13-208	Et	H	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基
13-209	Et	H	H	Me	5-Me-嘧啶-2-基
13-210	Et	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基
13-211	Et	H	H	Me	1,3-苯並噻唑-2-基
13-212	Et	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基
13-213	Et	H	H	Me	1,5-Me <sub>2</sub> -吡唑-3-基
13-214	Et	H	H	Me	5-Me-吡嗪-2-基
13-215	Et	H	H	Me	5-F-嘧啶-2-基
13-216	Et	H	H	Me	4,6-Me <sub>2</sub> -嘧啶-2-基
13-217	Et	H	H	Me	3-噁嗪基
13-218	Et	H	H	Me	6-Me-噁嗪-3-基
13-219	Et	H	H	Me	1,2,4-三嗪-3-基
13-220	Et	H	H	Me	6-Me-1,2,4-三嗪-3-基
13-221	Me	H	H	Me	5-Cl-吡啶-3-基
13-222	Me	H	H	Me	4-Br-3-Me-Ph
13-223	Me	H	H	Me	4-Cl-6-Me-吡啶-2-基
13-224	Me	H	H	Me	2-Me-吡啶-4-基
13-225	Me	H	H	Me	3,5-Cl <sub>2</sub> -Ph

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
13-226	Me	H	H	Me	喹啉-2-基
13-227	Me	H	H	Me	異喹啉-3-基
13-228	Me	H	H	Me	5-CF <sub>3</sub> -吡啶-2-基
13-229	Me	H	H	Me	6-OMe-吡啶-2-基
13-230	Me	H	H	Me	4-OMe-吡啶-2-基
13-231	Me	H	H	Me	4-Br-吡啶-2-基
13-232	Me	H	H	Me	4-Cl-吡啶-2-基
13-233	Me	H	H	Me	4-F-吡啶-2-基
13-234	Me	H	H	Me	3,4-Me <sub>2</sub> -Ph
13-235	Me	Me	H	Me	4-Cl-Ph
13-236	Me	Me	H	Me	5-Cl-吡啶-2-基
13-237	Me	Me	H	Me	5-Br-吡啶-2-基
13-238	Me	Me	H	Me	5-Br-嘧啶-2-基
13-239	Me	Me	H	Me	5-Cl-嘧啶-2-基
13-240	Me	H	H	Me	4-NO <sub>2</sub> -Ph
13-241	Me	Me	H	Me	2-吡啶基
13-242	Me	H	H	Me	5-烯丙基吡啶-2-基
13-243	Me	H	H	Me	5-環丙基吡啶-2-基
13-244	Me	H	H	Me	5-乙炔基吡啶-2-基
13-245	Me	H	H	Me	5-Ph-吡啶-2-基
13-246	Me	H	H	Me	3-Br-Ph
13-247	Me	H	H	Me	4-噻唑基
13-248	Me	H	H	Me	2-Cl-噻唑-4-基
13-249	Me	H	H	Me	2-Br-噻唑-4-基
13-250	Me	H	H	Me	5-OSO <sub>2</sub> Me-吡啶-2-基
13-251	Me	H	H	Me	6-Cl-1,3-苯並噻唑-2-基
13-252	Me	H	H	Me	6-Br-1,3-苯並噻唑-2-基
13-253	Me	H	H	Me	1,3-苯並噁唑-2-基
13-254	Me	H	H	Me	6-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基

編號	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
13-255	Me	H	H	Me	6-Br-1,3-苯並噁唑-2-基
13-256	Me	H	H	Me	7-Cl-1,3-苯並噁唑-2-基
13-257	Me	H	H	Me	5-NH <sub>2</sub> -吡啶-2-基
13-258	Me	H	H	Me	5-OH-吡啶-2-基
13-259	Me	H	H	Me	5-OCHF <sub>2</sub> -吡啶-2-基
13-260	Me	H	H	Me	5-MeO-吡啶-2-基
13-261	Me	H	H	Me	5-MeS-吡啶-2-基
13-262	Me	H	H	Me	5-NHMe-吡啶-2-基
13-263	Me	H	H	Me	5-NMe <sub>2</sub> -吡啶-2-基

## (B) 調配實例

- a) 藉由混合 10 重量份式(I)所示化合物和 90 重量份作為惰性物質的滑石並於鏈磨機內將混合物研磨成粉末以得粉劑。
- b) 可立即分散於水中之可潤濕性粉末係藉由混合 25 重量份式(I)所示化合物、64 重量份作為惰性物質之含高嶺土的石英、10 重量份木質磺酸鉀和 1 重量份作為潤濕劑和分散劑的油醯基甲基牛磺酸鈉，及於固定盤研磨機(pinned-disk mill)中研磨混合物而得到。
- c) 可立即分散於水中之分散濃縮液係藉由混合 20 重量份式(I)所示化合物與 6 重量份烷基酚聚乙二醇醚(®Triton X 207)、3 重量份異十三烷醇聚乙二醇醚(8EO)和 71 重量份石蠟無機油(沸點範圍例如約 255 至超過 277°C)及於球磨粉機(attrition ball mill)內研磨混合物至細度低於 5 微米而製得。
- d) 可乳化的濃縮液係由 15 重量份式(I)所示化合物、75 重量份作為溶劑的環己酮和 10 重量份作為乳化劑之乙氧基化的壬基酚而製得。
- e) 水可散的粒劑係藉由下列方法製得：混合下列組份
- 75 重量份式(I)所示化合物，
  - 10 重量份木質磺酸鈣，
  - 5 重量份硫酸月桂酯鈉，
  - 3 重量份聚乙烯醇，及
  - 7 重量份高嶺土，

於固定盤研磨機 (pinned-disk mill) 中研磨混合物及於流體化床中將粉末噴灑於作為粒化液體的水上以粒化該粉末而製得。

f) 水可散的粒劑亦可藉由下列方法製得：於膠體研磨機 (colloid mill) 中將下列組份均質化和預研磨成粉末，

25 重量份式 (I) 所示化合物，

5 重量份 2,2'-二萘基甲烷-6,6'-二磺酸鈉，

2 重量份油醯基甲基牛磺酸鈉，

1 重量份聚乙烯醇，

17 重量份碳酸鈣，及

50 重量份水，

接著於珠粒研磨機內研磨混合物，及於噴灑塔內利用單一物質噴嘴霧化和乾燥所得的懸浮體。

### (C) 生物實例

#### 1. 萌芽前除草作用及作物的相容性

將單子葉或雙子葉雜草或作物的種子置於木纖維栽盆內的沙質壤土中並覆蓋以土壤。接著將調配成可潤濕性粉末 (WP) 形態之本發明化合物 (I) 以水性懸浮液或乳液的形態在水施用比率 600 l/ha (轉換後) (添加 0.2% 潤濕劑) 的情況下應用至土壤表面。

在處理之後，將栽盆置於溫室內且保持在測試植物的良好生長條件下。約 3 週後，相較於未經處理的對照組，根據視覺觀察而對製劑的活性進行評分 (除草活性百分比

(%)：100%活性 = 植物死亡，0%活性 = 類似於對照組植物)。

本發明之化合物(I)在每公頃 0.32 kg 或更低活性物質的施用比率下對許多有害植物具有良好的萌芽前除草性活性。例如，表 1 至 12 中之化合物 1-28、1-154、2-2、2-16、2-28、2-116、2-120、2-132、2-117、1-116、1-119、1-210、1-214、1-236、2-47、2-64、2-65、2-124、2-135、2-148、2-155、2-215、2-217、2-224、2-241、2-240、2-243、2-249、3-4、3-25、3-26、3-112、3-121、3-135、3-36、3-161、3-176、3-353 和其他化合物，當利用萌芽前的方法以每公頃 0.32 kg 活性物質的比率施用時，對有害植物具有良好的除草活性，例如大穗看麥娘(*Alopecurus myosuroides*)、稗草(*Echinochloa crus galli*)、狗尾草(*Setaria viridis*)、和波斯婆婆納(*Veronica persica*)。

同時，當利用萌芽前的方法施用時，即使是在高活性化合物劑量的情況，本發明之化合物也不會傷害雙子葉作物(例如芸苔)，此外，其亦不會傷害禾本科作物(例如小麥和稻)。部份本發明之化合物具有高選擇性，其因此適合於利用萌芽前的方法防治農業作物中之非所欲的植物。

## 2. 萌芽後除草作用及作物的相容性

將單子葉或雙子葉雜草或作物的種子置於木纖維栽盆內的沙質壤土中、覆蓋以土壤、及於溫室內在良好生長條件下培育。播種後 2 至 3 週，在一葉期時處理測試植物。

接著將調配成可潤濕性粉末(WP)形態之本發明化合物(I)以水性懸浮液或乳液的形態在水施用比率 600 l/ha (轉換後)(添加 0.2%潤濕劑)的情況下噴灑在植物的綠色部份上。使測試植物處於溫室內在最佳生長條件下約 3 週，接著相較於未經處理的對照組，根據視覺觀察而對製劑的作用進行評分(除草活性百分比(%): 100%活性 = 植物死亡，0%活性 = 類似於對照組植物)。

由結果可知，本發明之化合物(I)在每公頃 0.32 kg 或更低活性物質的施用比率下對廣泛範圍之雜草和寬葉雜草具有良好的萌芽後除草活性。例如，表 1 至 12 中之化合物 1-28、1-154、2-2、2-16、2-28、2-116、2-120、2-132、2-117、1-116、1-119、1-210、1-214、1-236、2-47、2-64、2-65、2-124、2-135、2-148、2-155、2-215、2-217、2-224、2-241、2-240、2-243、2-249、3-4、3-25、3-26、3-112、3-121、3-161、3-135、3-136、3-176、3-353 和其他化合物，當利用萌芽後的方法以每公頃 0.32 kg 或更低活性物質的比率施用時，對有害植物具有良好的除草活性，例如燕麥草(*Avena fatua*)、稗草(*Echinochloa crus galli*)、多花黑麥草(*Lolium multiflorum*)、狗尾草(*Setaria viridis*)、波斯婆婆納(*Veronica persica*)、三色堇(*Viola tricolor*)、和大穗看麥娘(*Alopecurus myosuroides*)。

# 發明專利說明書

(本申請書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：98119943

※申請日：98年06月15日

※IPC分類：

一、發明名稱：(中文/英文)

經取代的1-(二噻基)吡唑-4-基乙酸類、彼之製法及彼作為除草劑和植物生長調節劑之用途

Substituted 1-(diazinyl)pyrazol-4-ylacetic acids, processes for their preparation and their use as herbicides and plant growth regulators

C07D 403/04 (2006.01)

C07D 401/14 (2006.01)

C07D 403/14 (2006.01)

C07D 405/12 (2006.01)

C07D 409/12 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

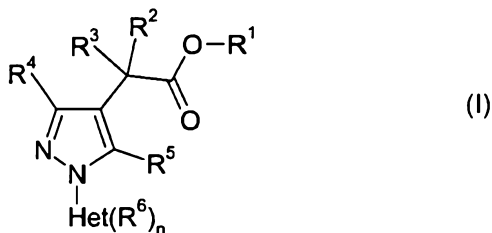
A01N 43/54 (2006.01)

A01N 43/60 (2006.01)

A01P 13/00 (2006.01)

二、中文發明摘要：

本發明係有關如下通式(I)所示之1-(3-二噻基)吡唑-4-基乙酸衍生物及其鹽類：

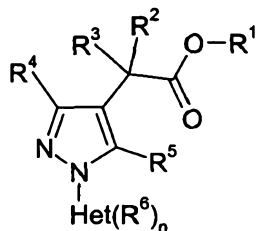


其中 Het、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>和 n 是如申請專利範圍第 1 項所定義。

化合物(I)和其鹽類適合作為除草劑和植物生長調節劑，特別是作為選擇性防治有用植物作物中之有害植物的除草劑，且其可利用申請專利範圍第 8 項之方法製造。

## 三、英文發明摘要：

The invention relates to 1-(3-diazinyl)pyrazol-4-ylacetic acid derivatives of the general formula (I) and salts thereof



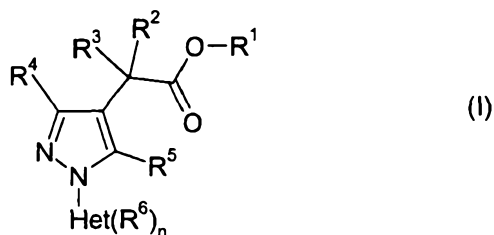
(I)

in which Het,  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ ,  $\text{R}^3$ ,  $\text{R}^4$ ,  $\text{R}^5$ ,  $\text{R}^6$  and n are as defined in claim 1.

The compounds (I) and their salts are suitable as herbicides and plant growth regulators, in particular as herbicides for the selctive control of harmful plants in crops of useful plants, and can be prepared by processes as described in claim 8.

## 七、申請專利範圍：

1. 一種如下式 (I) 所示化合物或其鹽



其中

Het 是具有 2 個雜原子作為環原子之 6-員雜芳族基團，其中該環中的雜原子是氮原子且環中至少一個氮原子是位於連結至吡啶基團的環碳原子之 1,3-位置，

$R^1$  是氫或可水解的基團，較佳是氫或任意經取代的烴基或任意經取代的雜環基團，其中該 2 個最後提及的含碳基團分別具有(含取代基) 1 至 30 個碳原子，或式  $SiR^aR^bR^c$ 、 $-NR^aR^b$  或  $-N=CR^cR^d$  所示的基團，

其中該 3 個最後提及的化學式中之各個基團  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$  和  $R^d$  彼此各自獨立地是氫或任意經取代的烴基，或  $R^a$  和  $R^b$  與氮原子一起為 3-至 9-員雜環，而其除了該氮原子以外可含有一或二個選自 N、O 和 S 之其他的環雜原子，且其是未經取代或經取代的，或  $R^c$  和  $R^d$  與碳原子一起為 3-至 9-員碳環基團或可含有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之雜環基團，其中該碳環或雜環基團是未經取代或經取代的，

其中該基團  $R^a$ 、 $R^b$ 、 $R^c$  和  $R^d$  分別具有(含取代基)至多 30 個碳原子，

$R^2$  是氫、鹵素、或  $(C_1-C_6)$ -烷基(未經取代或經一或多個選自鹵素、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基和  $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基之基團所取代)，

$R^3$  是氫、鹵素、或  $(C_1-C_6)$ -烷基(未經取代或經一或多個選自鹵素、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基和  $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基之基團所取代)，或

$R^2$  和  $R^3$  與所相連的碳原子一起為具有 3 至 6 個碳原子之飽和或部份未飽和的碳環，且其是未經取代或經一或多個選自鹵素和  $(C_1-C_4)$ -烷基之基團所取代，及

$R^4$  是氫、鹵素、氰基、 $(C_1-C_6)$ -烷基、 $(C_2-C_6)$ -烯基或  $(C_2-C_6)$ -炔基，其中該 3 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自鹵素、氰基、羥基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基- $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基和任意經鹵素、氰基、 $(C_1-C_4)$ -烷基或  $(C_1-C_4)$ -鹵烷基取代的  $(C_3-C_9)$ -環烷基之基團所取代，或較佳是未經取代或經一或多個選自鹵素、氰基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基- $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基和任意經鹵素、氰基、 $(C_1-C_4)$ -烷基或  $(C_1-C_4)$ -鹵烷基取代的  $(C_3-C_9)$ -環烷基之基團所取代，或

$(C_3-C_9)$ -環烷基、 $(C_5-C_9)$ -環烯基或  $(C_5-C_9)$ -環炔基，

其中該 3 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自鹵素、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基、 $(C_2-C_4)$ -烯基、 $(C_2-C_4)$ -炔基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基和 $(C_1-C_4)$ -烷硫基之基團所取代，或

苯基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素、氰基、硝基、羧基、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基、 $(C_2-C_4)$ -烯基、 $(C_2-C_4)$ -炔基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基- $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基、 $(C_1-C_4)$ -烷醯基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷醯基、 $[(C_1-C_4)$ -烷氧基]羰基和 $[(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基]羰基之基團所取代，或

$(C_1-C_6)$ -烷醯基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素、氰基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基- $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基和任意經鹵素、氰基、 $(C_1-C_4)$ -烷基或 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基取代的 $(C_3-C_6)$ -環烷基之基團所取代，或

$[(C_1-C_4)$ -烷氧基]羰基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素、氰基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基- $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基和任意經鹵素、氰基、 $(C_1-C_4)$ -烷基或 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基取代的 $(C_3-C_6)$ -環烷基之基團所取代，或

$[(C_3-C_9)$ -環烷氧基]羰基，其是未經取代或經一或多

個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、  
(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、  
(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基之基團所取代  
，

R<sup>5</sup> 是芳基，其是未經取代或經取代的，且具有(含取代  
基) 6 至 30 個碳原子，較佳是 6 至 24 個碳原子  
，特別是 6 至 20 個碳原子，或

具有 1 至 4 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之雜芳族基  
團，其是未經取代或經取代的，且具有(含取代  
基) 1 至 30 個碳原子，較佳是 1 至 24 個碳原子  
，特別是 1 至 20 個碳原子，及

(R<sup>6</sup>)<sub>n</sub> 是 n 個取代基 R<sup>6</sup>，其中當 n = 1 時之 R<sup>6</sup> 或當 n  
是大於 1 時之各個取代基 R<sup>6</sup> 彼此各自獨立地為下列  
基團：鹵素、羥基、胺基、硝基、羧基、氰基、胺甲  
醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧  
基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵  
烷硫基、單-或二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺基、羥基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-  
烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基、  
(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基  
、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷硫基、  
(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷硫基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
鹵烷氧基]羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷醯基  
、單-或二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺羰基、單-或二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-  
醯基]胺基、單-或二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺基、

N-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-醯基]-N-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]胺基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷亞磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷亞磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷磺醯基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-環烷基或(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環烯基，其中該 2 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基之基團所取代，及

n 是 0、1、2 或 3。

2. 如申請專利範圍第 1 項之式(I)所示化合物或其鹽，其中

R<sup>1</sup> 是 H、(C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>18</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>18</sub>)-炔基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-環烷基、(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環烯基、(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環炔基或苯基，

其中該 7 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：

鹵素、氰基、氫硫基(thio)、硝基、羥基、以及羧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵炔基(該 7 個最後提及的基團只有在環狀基礎基團的情況存在)、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔硫基、式-NR<sup>\*</sup>R<sup>\*\*</sup>、-CO-NR<sup>\*</sup>R<sup>\*\*</sup>和-O-CO-NR<sup>\*</sup>R<sup>\*\*</sup>所示的基團，

其中該 3 個最後提及的化學式中之各個基團 R<sup>\*</sup>

和  $R^{**}$  彼此各自獨立地是 H、 $(C_1-C_8)$ -烷基、 $(C_2-C_8)$ -烯基、 $(C_2-C_8)$ -炔基、苄基、經取代的苄基、苯基或經取代的苯基，或與氮原子一起為 3-至 8-員雜環，而其除了氮原子以外可含有一或二個選自 N、O 和 S 之其他的環雜原子，且其是未經取代或經一或多個選自  $(C_1-C_4)$ -烷基和  $(C_1-C_4)$ -鹵烷基之基團所取代，

及  $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]硫羰基、 $[(C_2-C_8)$ -烯氧基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ -炔氧基]羰基、 $[(C_1-C_8)$ -烷硫基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ -烯硫基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ -炔硫基]羰基、 $(C_1-C_8)$ -烷鹽基、 $[(C_2-C_8)$ -烯基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ -炔基]羰基、 $(C_1-C_4)$ -烷基亞胺基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基亞胺基、 $[(C_1-C_8)$ -烷基]羰胺基、 $[(C_2-C_8)$ -烯基]羰胺基、 $[(C_2-C_8)$ -炔基]羰胺基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]羰胺基、 $[(C_2-C_8)$ -烯氧基]羰胺基、 $[(C_2-C_8)$ -炔氧基]羰胺基、 $[(C_1-C_8)$ -烷基胺基]羰胺基、 $[(C_1-C_6)$ -烷基]羰氧基、 $[(C_2-C_6)$ -烯基]羰氧基、 $[(C_2-C_6)$ -炔基]羰氧基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]羰氧基、 $[(C_2-C_8)$ -烯氧基]羰氧基、 $[(C_2-C_8)$ -炔氧基]羰氧基、 $(C_1-C_8)$ -烷亞磺鹽基和  $(C_1-C_8)$ -烷磺鹽基，

其中該 27 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自鹵素、 $NO_2$ 、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基和任意經取代的苯基之基團所取代，

及苯基、苯基- $(C_1-C_6)$ -烷氧基、苯基- $[(C_1-C_6)$ -烷氧

基]羰基、苯氧基、苯氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、苯氧基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰基、苯氧羰基、苯羰氧基、以及苯氧羰氧基、苯羰胺基、苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]羰胺基、苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]羰氧基、以及苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰氧基、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-環烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-環烷氧基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧羰基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷羰氧基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧羰氧基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰氧基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷羰胺基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]羰胺基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]羰氧基，

其中該 26 個最後提及的基團分別亦任意地稠合至碳環或雜環，且於該環或多環系統中，是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基和硝基之基團所取代，

及下式所示的基團： $-\text{SiR}'_3$ 、 $-\text{O}-\text{SiR}'_3$ 、 $(\text{R}')_3\text{Si}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-烷氧基}$ 、 $-\text{CO}-\text{O}-\text{NR}'_2$ 、 $-\text{O}-\text{N}=\text{CR}'_2$ 、 $-\text{N}=\text{CR}'_2$ 、 $-\text{O}-\text{NR}'_2$ 、 $-\text{CH}(\text{OR}')_2$  和  $-\text{O}-(\text{CH}_2)_m-\text{CH}(\text{OR}')_2$ ，

其中各個基團 R' 彼此各自獨立地是 H、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基或苯基，且該苯基是未經取代或經

一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基和硝基之基團所取代，或經(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-伸烷基橋取代在 2 個相鄰的位置，及 m 是 0 至 6 之整數，

及式 R''O-CHR''''CH(OR'')-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基所示基團，其中各個基團 R''彼此各自獨立地是 H 或 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基，或基團 R''一起為 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-伸烷基，及 R''''是 H 或 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基，

以及式 Het<sup>1</sup> 所示基團，其中 Het<sup>1</sup> 在各個情況彼此各自獨立地為具有 3 至 9 個環原子之飽和、部份未飽和或雜芳族雜環基團，其中該雜環基團含有 1 至 4 個選自 N、O 和 S 之雜原子，且亦任意地亦稠合至碳環或雜環，及其於該環或多環系統中是未經取代或經一或多個選自鹵素、氰基、氫硫基、硝基、羥基、羧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔硫基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基]羰基和酮基之基團所取代，

或

$R^1$  是以  $(C_3-C_9)$ -環烷基、 $(C_5-C_9)$ -環烯基、 $(C_5-C_9)$ -環炔基或苯基為基礎的多環基團，其中該基礎環是稠合至碳環或雜環，和其中該基礎環或該多環系統是未經取代或經一或多個選自鹵素、氰基、氫硫基、硝基、羥基、羧基、 $(C_1-C_6)$ -烷基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基- $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_2-C_6)$ -烯基、 $(C_2-C_6)$ -鹵烯基、 $(C_2-C_6)$ -炔基、 $(C_2-C_6)$ -鹵炔基、 $(C_1-C_6)$ -烷氧基、 $(C_2-C_6)$ -烯氧基、 $(C_2-C_6)$ -炔氧基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基- $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_6)$ -烷硫基、 $(C_2-C_6)$ -烯硫基、 $(C_2-C_6)$ -炔硫基、 $(C_3-C_6)$ -環烷基、 $(C_3-C_6)$ -環烷氧基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_6)$ -鹵烷氧基]羰基和酮基之基團所取代，

或

$R^1$  是具有 3 至 9 個環原子之飽和、部份未飽和或雜芳族雜環基團，其含有 1 至 4 個選自 N、O 和 S 之雜原子，且是任意地稠合至碳環或雜環，及其於該環或多環系統中是未經取代或經一或多個選自鹵素、氰基、氫硫基、硝基、羥基、羧基、 $(C_1-C_6)$ -烷基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基- $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_2-C_6)$ -烯基、 $(C_2-C_6)$ -鹵烯基、 $(C_2-C_6)$ -炔基、 $(C_2-C_6)$ -鹵炔基、 $(C_1-C_6)$ -烷氧基、 $(C_2-C_6)$ -烯氧基、 $(C_2-C_6)$ -炔氧基、 $(C_1-C_6)$ -鹵烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基- $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_6)$ -烷硫基、 $(C_2-C_6)$ -烯硫基、 $(C_2-C_6)$ -炔硫基、

(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基]羰基和酮基之基團所取代。

3. 如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 所示化合物或其鹽，其中

R<sup>1</sup> 是 H、(C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>18</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>18</sub>)-炔基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-環烷基、(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環烯基、(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環炔基或苯基，

其中該 7 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素、氰基、氫硫基、硝基、羥基、以及羧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵炔基(該 7 個最後提及的基團只有在環狀基礎基團的情況存在)

、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔硫基、式 -NR<sup>\*</sup>R<sup>\*\*</sup>、-CO-NR<sup>\*</sup>R<sup>\*\*</sup> 和 -O-CO-NR<sup>\*</sup>R<sup>\*\*</sup> 所示的基團，

其中該 3 個最後提及的化學式中之基團 R<sup>\*</sup> 和 R<sup>\*\*</sup> 彼此各自獨立地是 H、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔基、苄基、經取代的苄基、苯基或經取代的苯基，或與氮原子一起為 3-至 8-員雜環，而其除了氮原子以外可含有一或

二個選自 N、O 和 S 之其他的環雜原子，且其是未經取代或經一或多個選自 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基和 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基之基團所取代，

及 [(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基]硫羰基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯氧基]羰基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔氧基]羰基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷硫基]羰基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯硫基]羰基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔硫基]羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷醯基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯基]羰基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔基]羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基亞胺基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基亞胺基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷基]羰胺基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯基]羰胺基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔基]羰胺基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基]羰胺基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯氧基]羰胺基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔氧基]羰胺基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷基胺基]羰胺基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]羰氧基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基]羰氧基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基]羰氧基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基]羰氧基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯氧基]羰氧基、[(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔氧基]羰氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷亞磺醯基和 (C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷磺醯基，

其中該 27 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自鹵素、NO<sub>2</sub>、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基和任意經取代的苯基之基團所取代，

及苯基、苯基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰基、苯氧基、苯氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、苯氧基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰基、苯氧羰基、苯羰氧基、以及苯氧羰氧基、以及苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰氧基、苯羰胺基、苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]羰胺基、苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-

烷基]羰氧基、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-環烷基和(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-環烷氧基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧羰基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷羰氧基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧羰氧基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]羰氧基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰氧基，

其中該 20 個最後提及的基團之環是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基和硝基之基團所取代，

及下式所示的基團： $-\text{SiR}'_3$ 、 $-\text{O}-\text{SiR}'_3$ 、 $(\text{R}')_3\text{Si}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-烷氧基}$ 、 $-\text{CO}-\text{O}-\text{NR}'_2$ 、 $-\text{O}-\text{N}=\text{CR}'_2$ 、 $-\text{N}=\text{CR}'_2$ 、 $-\text{O}-\text{NR}'_2$ 、 $-\text{CH}(\text{OR}')_2$  和  $-\text{O}-(\text{CH}_2)_m-\text{CH}(\text{OR}')_2$ ，

其中各個基團 R' 彼此各自獨立地是 H、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基或苯基，而該苯基是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基和硝基之基團所取代，或經(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-伸烷基橋取代在 2 個相鄰位置，及 m 是 0 至 6 的整數，

及式  $\text{R}''\text{O}-\text{CHR}'\text{'CH}(\text{OR}'')-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-烷氧基}$  所示基團，

其中各個基團 R'' 彼此各自獨立地是 H 或 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基，或其一起為 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-伸烷基，及 R''' 是 H 或 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基，

以及式 Het<sup>1</sup> 所示基團，其中 Het<sup>1</sup> 在各個情況彼此各自獨立地為具有 5 或 6 個環原子之飽和、部份

未飽和或雜芳族雜環基團，其中各個該雜環基團含有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 之環雜原子，且是任意地稠合至具有 0 或 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之 5-或 6-員碳環或雜環，且其於該環或多環系統中是未經取代或經一或多個選自鹵素、羥基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基和 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基之基團所取代。

4. 如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 所示化合物或其鹽，其中

R<sup>1</sup> 是 H、(C<sub>1</sub>-C<sub>18</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>18</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>18</sub>)-炔基、(C<sub>3</sub>-C<sub>9</sub>)-環烷基、(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環烯基、(C<sub>5</sub>-C<sub>9</sub>)-環炔基或苯基，

其中該 7 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：鹵素、氰基、氫硫基、硝基、羥基、以及羧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵炔基(該 7 個最後提及的基團只有在環狀基礎基團的情況存在)、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯氧基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-烯硫基、(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>)-炔硫基、式 -NR<sup>\*</sup>R<sup>\*\*</sup>、-CO-NR<sup>\*</sup>R<sup>\*\*</sup> 和 -O-CO-NR<sup>\*</sup>R<sup>\*\*</sup> 所示的基團，

其中該 3 個最後提及的化學式中之基團  $R^*$  和  $R^{**}$  彼此各自獨立地是 H、 $(C_1-C_8)$ -烷基、 $(C_2-C_8)$ -烯基、 $(C_2-C_8)$ -炔基、苄基、經取代的苄基、苯基或經取代的苯基，或與氮原子一起為 3-至 8-員雜環，而其除了氮原子以外亦可含有一或二個選自 N、O 和 S 之其他的環雜原子，且其是未經取代或經一或多個選自  $(C_1-C_4)$ -烷基和  $(C_1-C_4)$ -鹵烷基之基團所取代，

及  $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]羰基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]硫羰基、 $[(C_2-C_8)$ -烯氧基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ -炔氧基]羰基、 $[(C_1-C_8)$ -烷硫基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ -烯硫基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ -炔硫基]羰基、 $(C_1-C_8)$ -烷醯基、 $[(C_2-C_8)$ -烯基]羰基、 $[(C_2-C_8)$ -炔基]羰基、 $(C_1-C_4)$ -烷基亞胺基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基亞胺基、 $[(C_1-C_8)$ -烷基]羰胺基、 $[(C_2-C_8)$ -烯基]羰胺基、 $[(C_2-C_8)$ -炔基]羰胺基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]羰胺基、 $[(C_2-C_8)$ -烯氧基]羰胺基、 $[(C_2-C_8)$ -炔氧基]羰胺基、 $[(C_1-C_8)$ -烷基胺基]羰胺基、 $[(C_1-C_6)$ -烷基]羰氧基、 $[(C_2-C_6)$ -烯基]羰氧基、 $[(C_2-C_6)$ -炔基]羰氧基、 $[(C_1-C_8)$ -烷氧基]羰氧基、 $[(C_2-C_8)$ -烯氧基]羰氧基、 $[(C_2-C_8)$ -炔氧基]羰氧基、 $(C_1-C_8)$ -烷亞磺醯基和  $(C_1-C_8)$ -烷磺醯基，

其中該 27 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自鹵素、 $NO_2$ 、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基和任意經取代的苯基之基團所取代，

及苯基、苯基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰基、苯氧基、苯氧基-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、苯氧基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰基、苯氧羰基、苯羰氧基、以及苯氧羰氧基、以及苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰氧基、苯羰胺基、苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]羰胺基、苯基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]羰氧基、(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-環烷基和(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)-環烷氧基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧羰基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷羰氧基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧羰氧基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]羰氧基、以及(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羰氧基，

其中該 20 個最後提及的基團之環是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基和硝基之基團所取代，

及下式所示的基團： $-\text{SiR}'_3$ 、 $-\text{O}-\text{SiR}'_3$ 、 $(\text{R}')_3\text{Si}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-烷氧基}$ 、 $-\text{CO}-\text{O}-\text{NR}'_2$ 、 $-\text{O}-\text{N}=\text{CR}'_2$ 、 $-\text{N}=\text{CR}'_2$ 、 $-\text{O}-\text{NR}'_2$ 、 $-\text{CH}(\text{OR}')_2$  和  $-\text{O}-(\text{CH}_2)_m-\text{CH}(\text{OR}')_2$ ，

其中各個基團 R' 彼此各自獨立地是 H、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基或苯基，而該苯基是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基和硝基之基團所取代，或經(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-伸烷基橋取代在 2 個相鄰的位置，及 m 是 0 至 6 的整數，

及式  $\text{R}''\text{O}-\text{CHR}'\text{''}\text{''}\text{CH}(\text{OR}'')-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{-烷氧基}$  所示基團，

其中各個基團  $R''$  彼此各自獨立地是 H 或  $(C_1-C_4)$ -烷基，或其一起為  $(C_1-C_6)$ -伸烷基，及  $R'''$  是 H 或  $(C_1-C_4)$ -烷基，

以及式  $Het^1$  所示基團，其中  $Het^1$  在各個情況彼此各自獨立地為具有 5 或 6 個環原子之飽和、部份未飽和或雜芳族雜環基團，其中各個該雜環基團含有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 之環雜原子，且任意地亦稠合至具有 0 或 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之 5-或 6-員碳環或雜環，及其於該環或多環系統中是未經取代或經一或多個選自鹵素、羥基、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基和  $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基之基團所取代。

5. 如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 所示化合物或其鹽，其中

$R^2$  是氫、鹵素、或  $(C_1-C_4)$ -烷基 (未經取代或經一或多個選自鹵素之基團所取代)，及

$R^3$  是氫、鹵素、或  $(C_1-C_4)$ -烷基 (未經取代或經一或多個選自鹵素之基團所取代)，或

$R^2$  和  $R^3$  與所相連的碳原子一起為  $(C_3-C_6)$ -環烷基或  $(C_5-C_6)$ -環烯基，其中該 2 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自鹵素和  $(C_1-C_4)$ -烷基之基團所取代。

6. 如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 所示化合物或其鹽

，其中

$R^4$  是氫、鹵素、氰基、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_2-C_4)$ -烯基或  
 $(C_2-C_4)$ -炔基，其中該 3 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自鹵素和羥基之基團所取代，較佳是未經取代或經一或多個選自鹵素（例如氟和氯）之基團所取代，或

$(C_3-C_6)$ -環烷基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素和 $(C_1-C_4)$ -烷基之基團所取代，或

苯基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素、硝基、 $(C_1-C_4)$ -烷基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基- $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -烷硫基、 $[(C_1-C_4)$ -烷氧基]羰基和 $[(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基]羰基之基團所取代，或

$(C_1-C_4)$ -烷醯基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素（例如氟和氯）、氰基、 $(C_1-C_4)$ -烷氧基、 $(C_1-C_4)$ -鹵烷氧基和 $(C_1-C_2)$ -烷氧基- $(C_1-C_2)$ -烷氧基之基團所取代，較佳是甲醯基，或

$[(C_1-C_4)$ -烷氧基]羰基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素（例如氟和氯）之基團所取代，或

$[(C_3-C_6)$ -環烷氧基]羰基，其是未經取代或經一或多個選自鹵素和 $(C_1-C_4)$ -烷基之基團所取代。

7. 如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 所示化合物或其鹽

，其中

$R^5$  是苯基或具有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子之

5-或 6-員雜芳族基團，其中該苯基或該雜環基團是未經取代或經一或多個選自下列之基團所取代：

- (a) 鹵素、羥基、胺基、硝基、羧基、氰基和胺甲醯基，
- (b) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-烯基、(C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-炔基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烯氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-炔氧基，其中該 6 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺基、羥基、羧基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基]羧基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷氧基]羧基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺羧基和氰基之基團所取代，
- (c) (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷硫基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷氧基]羧基、[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基]羧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷醯基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺羧基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-醯基]胺基、單-和二-[(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基]胺基、N-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-醯基]N-[(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基]胺基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷亞磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷亞磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷亞磺醯氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷亞磺醯氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷磺醯氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷磺醯氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-烷基硫酸基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷基硫酸基，及
- (d) (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-環烷氧基、苯基和苯氧基，

其中該 4 個最後提及的基團分別是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基之基團所取代，及其中 2 個相鄰的取代基可形成稠合的 5-或 6-員環，而該環是碳環或可另外含有 1 至 3 個選自 N、O 和 S 的環雜原子，且該環是未經取代或經一或多個選自鹵素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-鹵烷氧基和(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基之基團所取代。

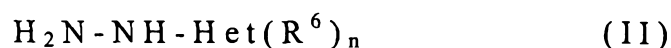
8. 如申請專利範圍第 1 項之式(I)所示化合物或其鹽，其中

(R<sup>6</sup>)<sub>n</sub> 是 n 個取代基 R<sup>6</sup>，其中當 n = 1 時之 R<sup>6</sup> 或當 n 是大於 1 時之各個取代基 R<sup>6</sup> 彼此各自獨立地為下列基團：鹵素、氰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷氧基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷硫基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷亞磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷亞磺醯基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-烷磺醯基或(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-鹵烷磺醯基，及

n 是 0、1、2 或 3。

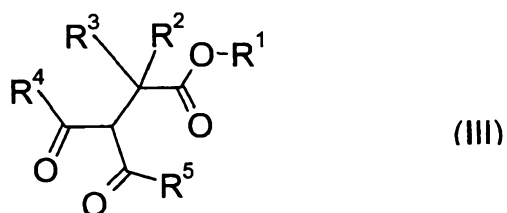
9. 一種製造如申請專利範圍第 1 項之式(I)所示化合物或其鹽之方法，其中

(a) 式(II)所示化合物，



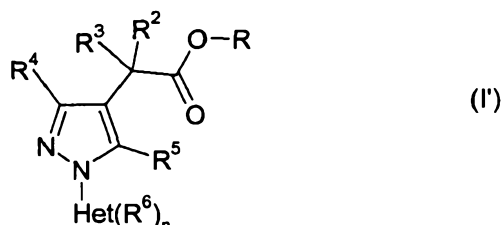
其中 Het 和 (R<sup>6</sup>)<sub>n</sub> 係如式(I)中所定義，

與式(III)所示化合物反應，



其中  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  和  $R^5$  係如式(I)中所定義，  
得式(I)所示化合物或其鹽，

(b) 如果式(I)中的  $R^1$  不是氫，則式(I')所示化合物，



其中 Het、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  和  $R^6$  係如式(I)中所  
定義，及

R 是不同於該基團  $R^1$  且不是氫，其係選自  $R^1$  中  
所定義的基團，或是式(I')中  $R = H$  的化合物之  
酸酐、鹵鹵或活化酯，

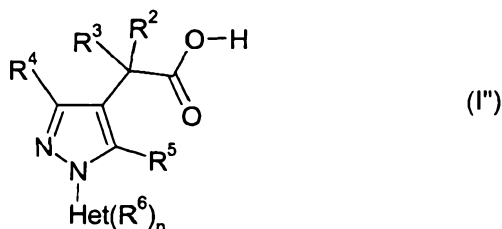
與式(IV)所示化合物反應，



其中  $R^1$  係如式(I)中所定義，  
得式(I)所示化合物，

或

(c) 如果式(I)中的  $R^1$  不是氫，則式(I'')所示化合物，



其中 Het、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  和  $R^6$  係如式(I)中所定義，

適當的話，在活化酸基後，與式(IV)所示化合物反應(酯化)



其中  $R^1$  係如式(I)中所定義，

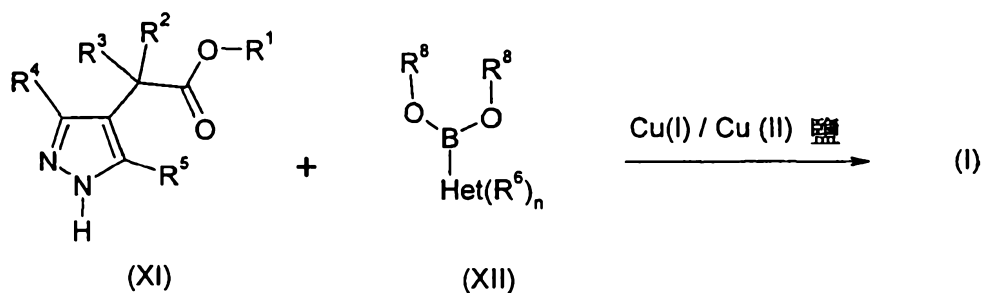
得式(I)所示化合物，

或

(d) 如果要製造的是式(I)中  $R = H$  的化合物或其鹽，則式(I')所示化合物[參見變體(b)的定義]被水解成式(I)所示化合物或其鹽，

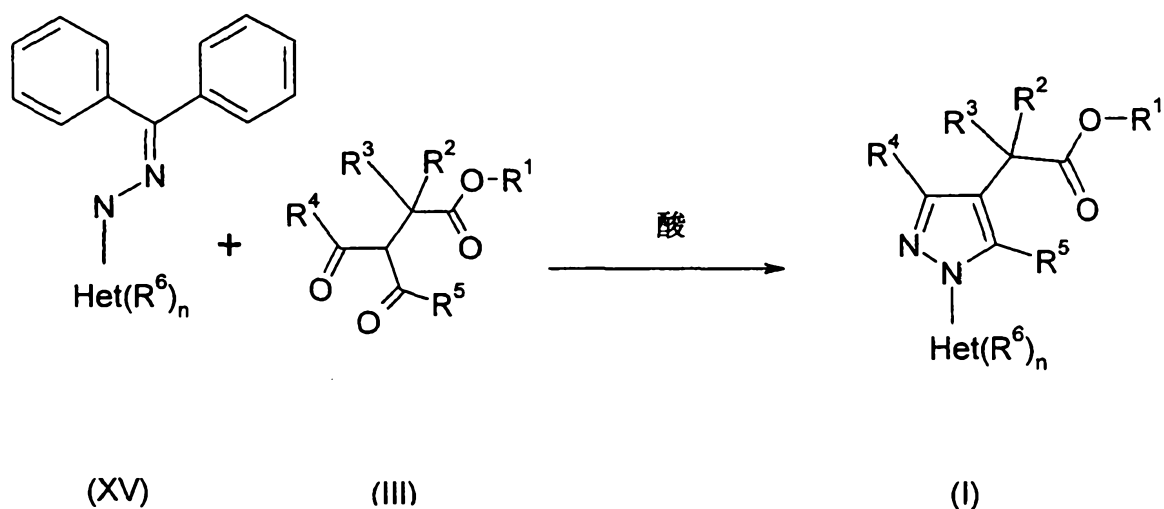
或

g) 通式(XI)所示化合物與式(XII)所示硼衍生物在 Cu(I) 或 Cu(II)鹽和有機鹼的存在下，適當的話於溶劑中，進行反應，



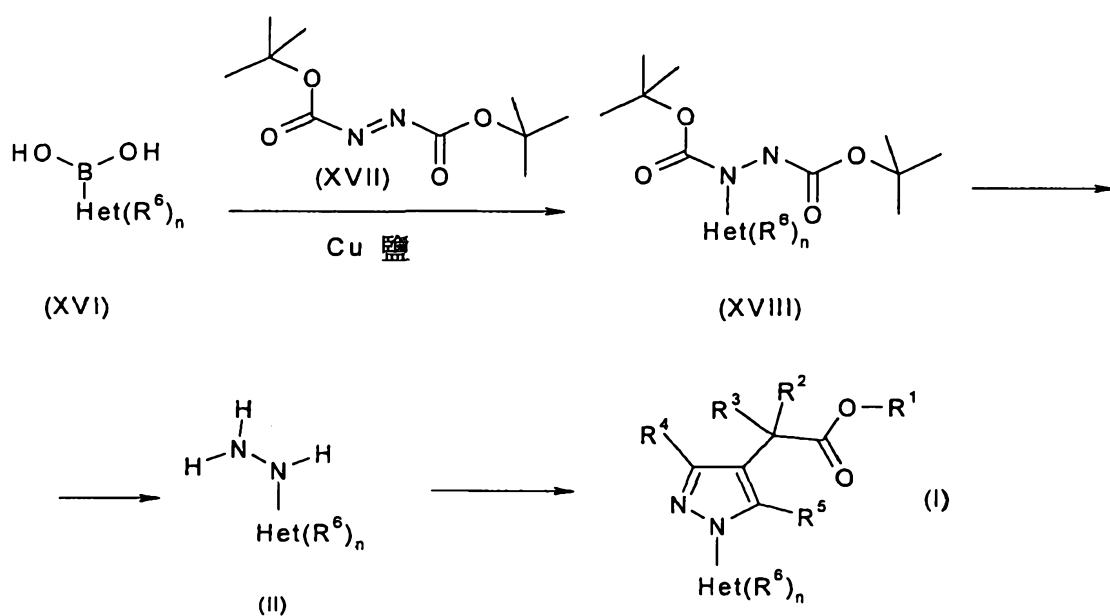
其中式 (XI) 和 (XII) 中之 Het、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  係如上述式 (I) 中所定義，及  $R^8$  是 H 或 ( $C_1$ - $C_6$ )-烷基，或 2 個烷基  $R^8$  連結形成環，  
或

h) 通式 (XV) 所示化合物與通式 (III) 所示化合物在酸的存在下，適當的話於溶劑中，進行反應，得式 (I) 所示化合物或其鹽，



其中式 (XV) 和 (III) 中之 Het、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$  係如式 (I) 中所定義，及 LG 是離去基，  
或

- i) 通式 (XVI) 所示化合物 (其中  $R^6$  係如式 (I) 中所定義) 與偶氮二甲酸二第三丁酯 (DBAD, XVII) 在銅鹽的存在下任意地於溶劑中進行反應, 得式 (XVIII) 所示化合物 (其中  $R^6$  係如式 (I) 中所定義), 其接著經由式 (II) 所示化合物或其鹽 (其中  $R^6$  係如式 (I) 中所定義) 以及步驟 a) 的方法轉換成式 (I) 所示化合物:



10. 一種除草性或植物生長調節性組成物, 其包括一或多種如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 所示化合物或其鹽, 及作物保護上慣用的調配助劑。

11. 一種防治有害植物或調節植物生長之方法, 其包括將有效量之一或多種如申請專利範圍第 1 項之式 (I) 所示化合物或其鹽施用於植物、植物種子或培育的區域。

12. 如申請專利範圍第 11 項之方法, 其中該式 (I) 所示化合物或其鹽係用於防治有害植物或調節有用植物或觀

賞植物的作物之生長。

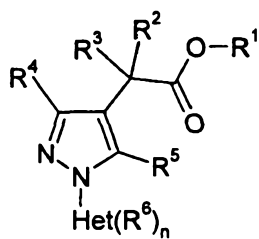
13. 如申請專利範圍第 12 項之方法，其中該作物是基因轉植作物。

四、指定代表圖：

(一) 本案指定代表圖為：無。

(二) 本代表圖之元件符號簡單說明：無

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：式 I



(I)