

發明專利說明書

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號：

91133874

※ 申請日期：

91. 9. 4

※IPC 分類：

C07D 277/62 (2006.01)

C07D 215/00 (2006.01)

C07D 239/72 (2006.01)

A01N 43/78 (2006.01)

A01N 43/42 (2006.01)

A01N 43/54 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

新穎的殺真菌劑 / NOVEL FUNGICIDES

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

先正達合夥公司 / SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

代表人：(中文/英文)

1. 喬瑟琳 塞若尼 / CERONI, JOCELYNE

2. 寇尼里亞 史基勒 / SCHILLER, CORNELIA

住居所或營業所地址：(中文/英文)

瑞士，4058 巴賽爾城，黑森林大道 215 號

Schwarzwaldallee 215, 4058 Basel, Switzerland

國 籍：(中文/英文)

瑞士 / Switzerland

三、發明人：(共 6 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 費歐納 瑪非 卡瑟比 / MURPHY KESSABI, Fiona

2. 漢斯 喬治 布魯諾 / BRUNNER, Hans-Georg

3. 雷諾 畢得金斯 / BEAUDEGNIES, Renaud

4. 蘿拉 括倫塔 QUARANTA, Laura

5. 佛瑞德克 西德伯 / CEDERBAUM, Fredrik

6. 傑恩特 優梅爾 / UMARYE, Jayant

國 籍：(中文/英文)

- 1.愛爾蘭 / Ireland
- 2.瑞士 / Switzerland
- 3.比利時 / Belgium
- 4.義大利 / Italy
- 5.瑞典 / Sweden
- 6.印度 / India

• **四、聲明事項：**

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

☒ 申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1. 英國、2007.09.05、0717256.2

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於新穎酸醯胺，用於製備彼等之方法，含有彼等之組合物及使用彼等對抗真菌、尤其植物真菌感染之方法。

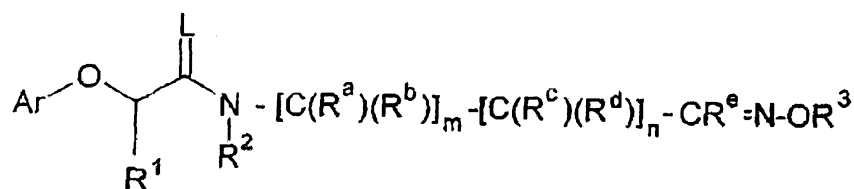
【先前技術】

某些酸醯胺衍生物及其作為農業及園藝殺菌劑之用途揭示於（例如）WO 04/047538 及 JP 2001-89453 中。

【發明內容】

本發明係關於提供主要用作植物殺菌劑之特定經取代之酸醯胺。

因此，根據本發明提供通式(1)之化合物：



(1)

其中：

Ar 為視需要經取代之 8-至 14 員飽和或不飽和二-或三環式環，

L 為 O 或 S；

R¹ 為 C₁₋₄ 烷基、鹵 C₁₋₄ 烷基或 C₃₋₄ 環烷基，或 C₁₋₄ 烷氧基、鹵(C₁₋₄)烷氧基或 C₃₋₄ 環烷氧基，或 C₁₋₄ 烷硫基，C₁₋₄ 烷基亞磺醯基，C₁₋₄ 烷基磺醯基，或鹵 C₁₋₄ 烷硫基，鹵(C₁₋₄)烷基亞磺醯基或鹵(C₁₋₄)烷基磺醯基，或 C₃₋₄ 環烷

硫基， C_{3-4} 環烷基亞磺基或 C_{3-4} 環烷基磺基；

R^2 為氫、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-4} 環烷基、 C_{2-8} 烯基、氰基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷氧基(C_{1-4})烷基或苄氧基(C_{1-4})烷基，其中苄基部分之苯環視情況經 C_{1-4} 烷氧基取代；

R^a 與 R^b 彼此獨立地為氫、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷基， C_{3-5} 烯氧基(C_{1-4})烷基， C_{3-5} 炔氧基(C_{1-4})烷基， C_{1-4} 羥烷基，氰基， C_{2-4} 炔基， C_{2-4} 烯基或(C_{1-4})烷氧基羰基，甲磺基， C_{1-3} 烷氧基(C_{1-3})烷基(C_{1-3})炔基， C_{1-3} 烯氧基(C_{1-3})烷基(C_{1-3})炔基， C_{1-3} 炔氧基(C_{1-3})烷基(C_{1-3})炔基或羥基(C_{1-3})烷基(C_{1-3})炔基，

R^c 與 R^d 彼此獨立地為氫、 C_{1-4} 烷基、鹵素，氰基，羥基， C_{1-4} 烷氧基或(C_{1-4})烷氧基羰基，或

R^a 與 R^b 或 R^c 與 R^d 一起與其所連接的碳形成 3 至 6 員碳環式或雜環式之環，其包含選自硫，氧，氮及 NR^0 之雜原子，其中 R^0 為氫或視需要經取代之 C_{1-4} 烷基，

R^e 為氫或 C_{1-4} 烷基、苯基，苄基，噻吩基甲基或吡啶基甲基，

R^3 為氫，視需要經取代之 C_{1-6} 烷基、視需要經取代之 C_{3-6} 環烷基，其視需要包含選自氧、硫或氮之雜原子，視需要經取代之 C_{2-4} 烯基，視需要經取代之 C_{2-6} 炔基， C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷基， C_{3-5} 烯基氧基(C_{1-4})烷基， C_{3-5} 炔基氧基(C_{1-4})烷基，視需要經取代之芳基或視需要經取代之雜芳基，

m 為 1 或 2，

n 為 0，1 或 2，以及

式(1)化合物之鹽及 N-氧化物，

其限制條件為當 Ar 為喹啉-6-基基團且 R^1 為 C_{1-4} 烷硫基， C_{1-4} 烷基亞磺基或 C_{1-4} 烷基磺基，或鹵(C_{1-4})烷硫基，鹵(C_{1-4})烷基亞磺基或鹵(C_{1-4})烷基磺基，或 C_{3-4} 環烷硫基， C_{3-4} 環烷基亞磺基或 C_{3-4} 環烷基磺基，則喹啉-6-基之 7 位置未經取代。

本發明之化合物含有至少一個不對稱碳原子且可以對映異構物形式（或以非對映異構物對形式）或以其混合物形式存在。另外，當 R^1 為 C_{1-4} 烷基亞磺基時，本發明之化合物為亞磺，其可以兩種對映異構形式存在，且相鄰碳亦可以兩種對映異構形式存在。

再者，本發明化合物的 C=N 雙鍵附近的異構化作用可能存在，藉此導致通式(1)的化合物之立體化學異構形式。如果為本發明化合物係以 E 和 Z 異構物形式存在，本發明包括個別異構物以及其混合物。

因此，通式(I)之化合物可以外消旋物、非對映異構物或單一對映異構物形式存在，且本發明包括所有可能的異構物或以各種比例之異構物混合物。預期對於任一給定化合物，一種異構物可能比另一種殺真菌更有效。式(1)化合物之 N-氧化物較佳地表示形成之 N-氧化物，例如，當 Ar 為喹啉基或喹啉基部分。

式 I 化合物可形成之鹽較佳地為由該等化合物與酸相

互作用而形成之鹽。術語「酸」包含諸如氫鹵酸、硫酸、磷酸等之無機酸以及有機酸，較佳地通常使用之烷酸，例如甲酸、乙酸及丙酸。

除非另有說明，否則烷基、烷硫基等之烷基及烷基部分適當地含有 1 至 8 個、通常 1 至 4 個呈直鏈或支鏈形式之碳原子。實例為甲基、乙基、正丙基及異丙基及正丁基、第二丁基、異丁基及第三丁基。若烷基部分含有 5 或 6 個碳原子，則實例為正戊基及正己基。烷基及烷基部分之適當可選用取代基之實例包括鹵基、羥基、 C_{1-4} 烷氧基及 C_{1-4} 烷氧基 (C_{1-4}) 烷氧基、氰基、視情況經取代之芳基及視情況經取代之雜芳基。若可選取代基為鹵基，則鹵烷基或鹵烷基部分通常為單氟甲基、單氯甲基、單氟乙基，二氟甲基，二氯甲基、三氟甲基或三氯甲基。較佳之取代基為鹵素，羥基， C_{1-4} 烷氧基和 C_{1-4} 烷氧基 (C_{1-4}) 烷氧基和氰基。

環烷基基團合適地包含 3 或 6 個碳原且為環丙基，環丁基，環戊基或環己基。

除非另有說明，否則烯基及炔基部分亦適當地含有 2 至 6 個、通常 2 至 4 個呈直鏈或支鏈形式之碳原子。實例為烯丙基、乙炔基及炔丙基。

環烷基，烯基和炔基上可選用的取代基包括鹵素，烷氧基烷基，烯基烷基，炔基烷基，鹵烷基，氰基烷基，羥基烷基，烷氧基，視需要經取代之芳基和視需要經取代之雜芳基。

較佳之取代基為鹵基、 C_{1-4} 烷氧基 (C_{1-3}) 烷基， C_{2-4} 烯基 (C_{1-3}) 烷基， C_{2-4} 炔基 (C_{1-3}) 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基， C_{1-4} 氰烷基， C_{1-4} 羥基烷基， C_{1-4} 烷氧基，

鹵基包括氟、氯、溴及碘。

芳基較佳為苯基，但亦包括二環和三環式環，例如萘基、蒽基及菲基，較佳為萘基。

雜芳基通常為含有一或多個硫、氧、氮或 NR^0 部分作為雜原子之 5 或 6 員芳香族環，其可稠合至一或多個其他芳香族環或雜芳香族環，諸如苯環。其實例為噻吩基、呋喃基、吡咯基、異噁唑基、噁唑基、噻唑基、噁二唑基、吡唑基、咪唑基、三唑基、異噻唑基、四唑基、噻二唑基、吡啶基、嘧啶基、吡嗪基、噻嗪基、三嗪基、苯并呋喃基、苯并噻吩基、二苯并呋喃基、二苯并噻吩基、苯并噻唑基、苯并噁唑基、苯并咪唑基、吲哚基、喹啉基、異喹啉基、喹唑啉基及喹諾啉基，以及（若適當者）其 N -氧化物及鹽。芳基或雜芳基值之任一者視情況經取代。較佳的環係為苯并呋喃基、苯并噻吩基、喹啉基、以及喹唑啉基。

8-至 14-員環 Ar 為二環系統或三環系統，其可為飽和或不飽和。其包括碳環以及雜環，芳基和雜芳基，其中雜和雜芳基通常包括硫，氧，氮或 NR^0 部分，其中 R^0 為氫，烷基，其可經取代。

除非另有說明，否則可存在於二環式環和三環式環以及芳基和雜芳基之取代基例如包括以下基團之一或多者：鹵基、羥基、巰基、 C_{1-6} 烷基（尤其是甲基及乙基）、 C_2

$-_6$ 烯基（尤其是乙烯基和烯丙基）、 C_{2-6} 炔基（尤其是乙炔基，炔丙基）、三烷基矽烷基乙炔基（尤其是三甲基矽烷基乙炔基）、3-羥基-3-(C_{1-4})烷基(C_{3-6})烷-1-炔-1-基（尤其是3-羥基-3-甲基-丁-1-炔-1-基）、 C_{1-6} 烷氧基（尤其是甲氧基）、 C_{2-6} 烯氧基（尤其是烯丙氧基）、 C_{2-6} 炔氧基（尤其是炔丙氧基）、鹵基(C_{1-6})烷基（尤其是三氟甲基）、鹵基(C_{1-6})烷氧基（尤其是三氟甲氧基）、 $-S(O)_u(C_{1-6})$ 烷基（其中 u 為 0、1 或 2，且烷基視情況經鹵基取代）、羥基(C_{1-6})烷基、 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷氧基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、其視情況經取代之芳基（尤其視情況經取代之苯基）、視情況經取代之雜芳基（尤其視情況經取代之吡啶基、嘧啶基或噻吩基）、視情況經取代之芳氧基（尤其是視情況經取代之苯氧基）、視情況經取代之雜芳氧基（尤其是視情況經取代之吡啶氧基或嘧啶氧基）、視情況經取代之 $-S(O)_p$ 芳基（其中 mp 為 0、1 或 2）（尤其是視情況經取代之苯硫基）、視情況經取代之 $-S(O)_q$ 雜芳基（其中 q 為 0、1 或 2）（尤其是視情況經取代之吡啶硫基或嘧啶硫基）、視情況經取代之芳基(C_{1-4})烷基（尤其是視情況經取代之苄基、視情況經取代之苯乙基及視情況經取代之苯基正丙基）（其中烷基部分視情況經羥基取代）、視情況經取代之雜芳基(C_{1-4})烷基（尤其是視情況經取代之吡啶基-(C_{1-4})烷基或嘧啶基-(C_{1-4})烷基）、視情況經取代之芳基(C_{2-4})烯基（尤其是視情況經取代之苯基乙烯基）、視情況經取代

之雜芳基(C_{2-4})烯基(尤其是視情況經取代之吡啶基乙烯基或噻啶基乙烯基)、視情況經取代之芳基(C_{1-4})烷氧基(尤其是視情況經取代之苄氧基及苯乙氧基)、視情況經取代之雜芳基(C_{1-4})烷氧基(尤其是視情況經取代之吡啶基(C_{1-4})烷氧基或噻啶基(C_{1-4})烷氧基)、視情況經取代之芳氧基(C_{1-4})烷基(尤其是苯氧基甲基)、視情況經取代之雜芳氧基-(C_{1-4})烷基(尤其是視情況經取代之吡啶氧基或噻啶氧基(C_{1-4})烷基)、視情況經取代之 $-S(O)_r(C_{1-4})$ 烷基芳基(其中 r 為 0、1 或 2)(尤其是視情況經取代之苄硫基及苯乙硫基)、視情況經取代之 $-S(O)_s(C_{1-4})$ 烷基雜芳基(其中 s 為 0、1 或 2)(尤其是視情況經取代之吡啶基(C_{1-4})烷硫基或噻啶基(C_{1-4})烷硫基)、視情況經取代之 $-(C_{1-4})$ 烷基 $S(O)_y$ 芳基(其中 y 為 0、1 或 2)(尤其苯硫基甲基)、視情況經取代之 $-(C_{1-4})$ 烷基 $S(O)_x$ 雜芳基(其中 x 為 0、1 或 2)(尤其是視情況經取代之吡啶硫基(C_{1-4})烷基或噻啶硫基(C_{1-4})烷基)、鹽氧基(包括 C_{1-4} 烷鹽氧基(尤其是乙鹽氧基)及苄鹽氧基)、氰基、異氰基、硫氰基、異硫氰基、硝基、 NR^gR^h 、 $-NHCOR^g$ 、 $-NHCONR^gR^h$ 、 $-CONR^gR^h$ 、 $-CO_2R^g$ 、 $-SO_2R^i$ 、 $-OSO_2R^i$ 、 $-COR^g$ 、 $-CR^g=NR^h$ 或 $-N=CR^gR^h$ ，其中 R^i 為 C_{1-4} 烷基、鹵基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基、鹵基(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯基或苄基，苯基及苄基視情況經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代，且 R^g 及 R^h 獨立地為氫、 C_{1-4} 烷基、鹵基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基、

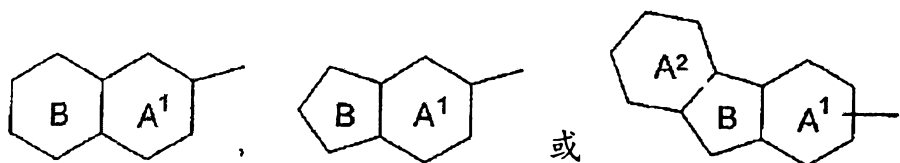
鹵基 (C_{1-4}) 烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基 (C_{1-4}) 烷基、苯基或苄基，苯基及苄基視情況經鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代。

較佳之取代基為鹵素， C_{1-6} 烷基，特別是甲基和乙基， C_{2-6} 烯基，特別是乙烯基和烯丙基， C_{2-6} 炔基，特別是乙炔基和炔丙基，三烷基矽烷基乙炔基，特別是三甲基矽烷基乙炔基，3-羥基-3-(C_{1-4}) 烷基 (C_{3-6}) 烷-1-炔-1-基，特別是 3-羥基-3-甲基-丁-1-炔-1-基，苯基，吡啶基，嘧啶基和噻吩基。

可藉由 R^a 一起與 R^b ，或者 R^c 一起與 R^d 一起與其所連接的碳原子形成的環合適地為飽和或不飽和，3 至 6 員碳環式或雜環式環，其包含選自硫，氧，氮和 NR^0 之雜原子，其中 R^0 為氫或視需要經取代之 C_{1-4} 烷基。

較佳者，在式(1)化合物中， R^a 和 R^b 彼此獨立地為氫， C_{1-4} 烷基， C_{1-4} 鹵烷基， C_{1-4} 烷氧基 (C_{1-4}) 烷基， C_{1-4} 羥基烷基，氰基， C_{2-4} 炔基， C_{2-4} 烯基或 C_{1-4} 烷氧基羰基。

特別重要者為該等式(1)化合物，其中 Ar 為下式基



其中

A^1 為視需要經取代之苯基，

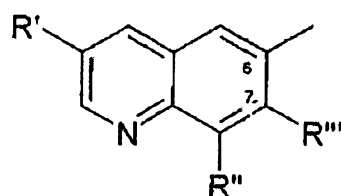
A^2 為視需要經取代之 6-員芳香族環，以及

B 為飽和、部分飽和或不飽和、視需要經取代之 5-或 6-員環，其視需要包含選自硫，氧，氮和 NR^0 之雜原子，

其中 R^0 為氫或視需要經取代之 C_{1-4} 烷基。

另一組式(1)較佳化合物為該等其中 B 包含 1 或 2 個氮原子或 NH 基團。

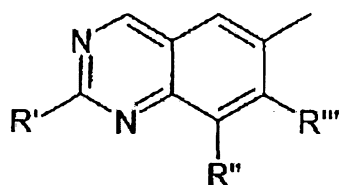
另一組式(1)較佳化合物為該等其中 Ar 為萘基，喹啉基或喹唑啉基環；更佳者，Ar 為萘-2-基，喹啉-6-基或喹唑啉-6-基；特別者，Ar 為下式基



R' 為氫，鹵素， C_{1-4} 烷基， C_{2-4} 烯基， C_{2-4} 炔基，三烷基矽烷基乙炔基或 3-羥基-3-甲基-丁-1-炔-1-基，以及

R'' 和 R''' 彼此獨立地為氫， C_{1-3} 烷基(特別是甲基)或鹵素，或

Ar 為下式基



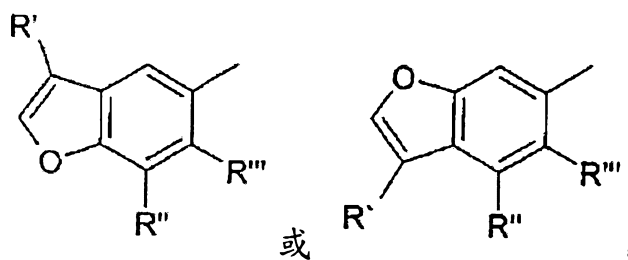
其中

R' 為氫，鹵素， C_{1-4} 烷基或 C_{2-4} 炔基，以及

R'' 和 R''' 彼此獨立地為氫，甲基，乙基或鹵素。

另一組式(1)較佳化合物為該等其中 Ar 為四咪基，四氫喹啉基，二氫色烯，苯並噁 thioly1，苯並噁二唑基，苯並

異噁唑基，吡啶基，

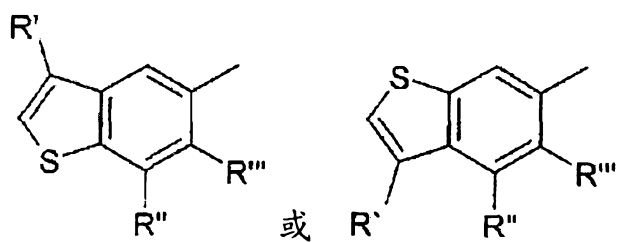


其中

R' 為氫，鹵素，C₁₋₄ 烷基，C₂₋₄ 烯基或 C₂₋₄ 炔基，以及

R'' 和 R''' 彼此獨立地為氫，甲基，乙基或鹵素，或

Ar 為下式基

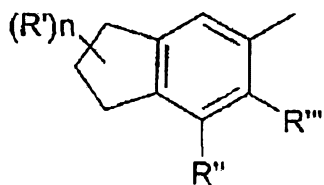


其中

R' 為氫，鹵素，C₁₋₄ 烷基，C₂₋₄ 烯基或 C₂₋₄ 炔基，以及

R'' 和 R''' 彼此獨立地為氫，甲基，乙基或鹵素，或

Ar 為下式基



其中

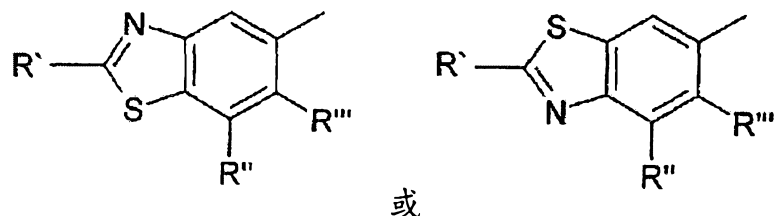
R' 為氫，鹵素，C₁₋₄ 烷基，C₂₋₄ 烯基或 C₂₋₄ 炔基，以

及

n 為 0 至 6，以及

R'' 和 R''' 彼此獨立地為氫，甲基，乙基或鹵素，或

Ar 為下式基



其中

R' 為氫，鹵素， C_{1-4} 烷基， C_{2-4} 烯基或 C_{2-4} 炔基，以

及

R'' 和 R''' 彼此獨立地為氫，甲基，乙基或鹵素。

較佳者， R' ， R'' 和 R''' 為氫。

亦較佳者， R' 為氫， R'' 為氫和 R''' 為氫，甲基，乙基或鹵素。

亦較佳者， R' 為氫， R'' 為氫或甲基和 R''' 為甲基。

應留意的是，在以上所顯示的 Ar 式中，取代基 R' ， R'' 和 R''' 具有獨立賦予彼等之意義。

另一組較佳之式 (I) 化合物為該等其中 Ar 為二苯並呋喃基，二苯並硫苯基，芴基或卡巴唑環；較佳者，Ar 為二苯並呋喃-3-基，二苯並硫苯基-3-基，芴-3-基或卡巴唑-3-基環。

另一組較佳之式 (I) 化合物為，其中 Ar 經以下基團取代：鹵素、氰基、硝基、疊氮基、 C_{1-6} 烷基、鹵基 (C_{1-6}) 烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基 (C_{1-4}) 烷基、 C_{2-6} 烯基、

鹵基(C_{2-6})烯基、 C_{2-6} 炔基、三烷基矽烷基乙炔基(特別是三甲基矽烷基乙炔基)，3-羥基-3- C_{1-4} 烷基- C_{3-6} 炔-1-基(特別是3-羥基-3-甲基-丁-1-炔基)，鹵基(C_{2-6})炔基、 C_{1-6} 烷氧基、鹵基(C_{1-6})烷氧基、 C_{2-6} 烯氧基、鹵基(C_{2-6})烯氧基、 C_{2-6} 炔氧基、鹵基(C_{2-6})炔氧基、芳基、芳氧基、芳基(C_{1-6})烷基、芳基(C_{1-6})烷氧基、雜芳基、雜芳氧基、雜芳基(C_{1-6})烷基、雜芳基(C_{1-6})烷氧基、 $-SF_5$ 、 $-S(O)_u(C_{1-4})$ 烷基，其中 u 為 0、1 或 2，且烷基視情況經鹵基取代， $-OSO_2(C_{1-4})$ 烷基取代，其中烷基視情況經鹵基取代； $-CONR^uR^v$ 、 $-COR^u$ 、 $-CO_2R^u$ 、 $-R^u=NR^v$ 、 $-NR^uR^v$ 、 $-NR^uCOR^v$ 、 $-NR^uCO_2R^v$ 、 $-SO_2NR^uR^v$ 或 $-NR^uSO_2R^w$ 取代，其中 R^w 為視情況經鹵素取代之 C_{1-6} 烷基且 R^u 和 R^v 彼此獨立地為氫或視情況經鹵素取代之 C_{1-6} 烷基，或在一 $CONR^uR^v$ 或 $-SO_2NR^uR^v$ 情況下，可連接以形成含有選自單一氮原子，單一硫原子，飽和碳原子及視需要單一氧原子的 5 或 6 員環；

其中任何上述烷基，環烷基，烯基，炔基，芳基或雜芳基或部分視需要經取代。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 A^1 為視需要經 C_{1-4} 烷基或鹵素取代者。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 A^2 為視需要經 C_{1-4} 烷基(特別是甲基或乙基)或鹵素取代者。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 B 為視需要經 C_{1-4} 烷基， C_{2-4} 烯基， C_{2-4} 炔基或鹵素取代者。

較佳者，B 被 C_{2-4} 烷基， C_{2-4} 炔基或鹵素取代。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 R^1 為 C_{1-4} 烷基，鹵(C_{1-4})烷基， C_{1-4} 烷氧基，鹵(C_{1-4})烷氧基， C_{1-4} 烷硫基或鹵(C_{1-4})烷硫基；較佳者， R^1 為乙基，甲氧基，乙氧基或甲硫基。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 R^2 為氫， C_{1-8} 烷基， C_{3-4} 環-烷基， C_{2-8} 烯基，氰基(C_{1-4})烷基， C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷基， C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷氧基 C_{1-4} 烷基；較佳者， R^2 為氫。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 R^3 為氫，視需要經取代之 C_{1-4} 烷基，視需要經取代之 C_{3-6} 環烷基(其視需要包含氧原子)，視需要經取代之 C_{2-4} 烯基，視需要經取代之(C_{2-4})炔基或 C_{1-3} 烷氧基(C_{1-3})烷基羰基。

更佳者， R^3 為氫， C_{1-4} 烷基，鹵 C_{1-4} 烷基，氰基 C_{1-4} 烷基，苄基， C_{1-3} 烷氧基(C_{1-3})烷基羰基， C_{3-4} 環烷基， C_{3-4} 烯基或 C_{3-4} 炔基。

特佳者， R^3 為氫，甲基，氰基甲基，氟甲基，乙基，烯丙基，炔丙基或丁-2-炔-4-基。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 n 為 0 者。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 R^e 為氫且 n 為 0 者。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 m 為 1 者。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 R^e 為氫且 m 為 1 者。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 m 為 1， n 為 1 且

R^c 及 R^d 為氫者。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 R^e 為氫， m 為 1， n 為 1 且 R^c 及 R^d 為氫者。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 m 為 1 且 n 為 0 者。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 R^e 為氫， m 為 1 且 n 為 0 者。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 R^a 為氫或甲基，且 R^b 為氫，甲基，氰基，乙炔基，甲氧基甲基，烯丙基甲基或炔丙基氧基甲基。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 R^a 為甲基且 R^b 為甲基，氰基，乙炔基，甲氧基甲基，烯丙基氧基甲基或炔丙基氧基甲基。

較佳， R^a 為甲基且 R^b 為甲基或氰基。

或者， R^a 為甲基， R^b 為甲基或乙炔基。

或者， R^a 為甲基， R^b 為甲基或甲氧基甲基。

或者， R^a 為甲基， R^b 為甲基或炔丙基氧基甲基。

或者，較佳者， R^a 為甲基， R^b 為甲基。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 R^e 為氫， R^a 為氫或甲基且 R^b 為氫，甲基，氰基，乙炔基，甲氧基甲基，烯丙基氧基甲基或炔丙基氧基甲基。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 R^e 為甲基且 n 為 0 者。

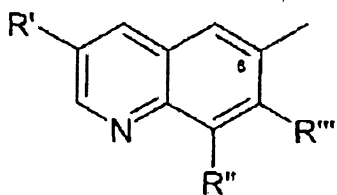
另一組較佳式(I)化合物為該等其中 R^e 為甲基且 m 為 1 者。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 R^c 為甲基， m 為 1， n 為 1 且 R^c 及 R^d 為氫者。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 R^c 為甲基， m 為 1， n 為 0 且 R^c 及 R^d 為氫者。

另一組較佳式(I)化合物為該等其中 R^c 為甲基， R^a 為氫或甲基且 R^b 為氫，甲基，氰基或乙炔基。

特佳之式(I)化合物為該等其中 Ar 為下式基



其中

R' 為溴，碘或乙炔基， R'' 為氫， R''' 為氫或氟，

R^1 為乙基，甲氧基或甲硫基， R^2 為氫， m 為 1， R^a 和 R^b 彼此獨立地為甲基，甲氧基甲基，炔丙基氧基甲基，乙炔基，甲醯基或氰基， n 為 0， R^c 為氫且 R^3 為氫或甲基。

更佳者，在此等化合物中， R' 為溴， R'' 和 R''' 為氫， R^1 為甲氧基或甲硫基， R^a 和 R^b 為甲基且 R^3 為甲基。

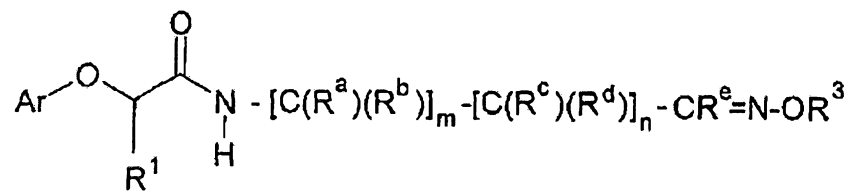
更佳者，在此等化合物中， R' 為碘， R'' 和 R''' 為氫， R^1 為甲氧基或甲硫基， R^a 和 R^b 為甲基且 R^3 為甲基。

更佳者，在此等化合物中， R' 為乙炔基， R'' 和 R''' 為氫， R^1 為甲氧基或甲硫基， R^a 和 R^b 為甲基且 R^3 為甲基。

形成本發明一部分之化合物係例示於以下表 1 至 329。熔點(mp)及/或診斷分子離子(例如 M^+ , $[M+1]^+$ 值)及/或光譜(^1H NMR)數據係提供於實施例 1, 2, 3 和 4，而生物活性

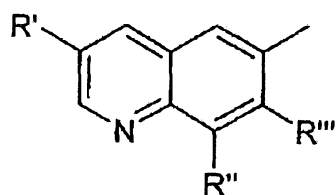
提供於實施例 5。

式 1a 化合物：



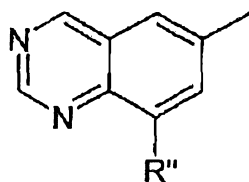
(1a)

表 A：定義為 Ar1 至 Ar83 之式 1a 之 Ar

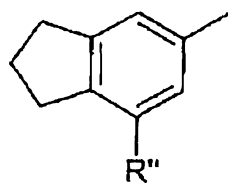


	R'	R''	R'''
Ar1	氯	氫	氫
Ar2	氯	氟	氫
Ar3	氯	氯	氫
Ar4	氯	溴	氫
Ar5	氯	碘	氫
Ar6	氯	甲基	氫
Ar7	溴	氫	氫
Ar8	溴	氟	氫
Ar9	溴	氯	氫
Ar10	溴	溴	氫
Ar11	溴	碘	氫
Ar12	溴	甲基	氫

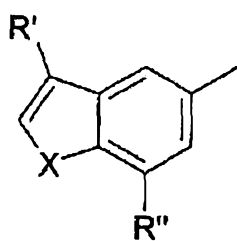
Ar13	碘	氫	氫
Ar14	碘	氟	氫
Ar15	碘	氯	氫
Ar16	碘	溴	氫
Ar17	碘	碘	氫
Ar18	碘	甲基	氫
Ar19	乙炔基	氫	氫
Ar20	乙炔基	氟	氫
Ar21	乙炔基	氯	氫
Ar22	乙炔基	溴	氫
Ar23	乙炔基	碘	氫
Ar24	乙炔基	甲基	氫
Ar25	丙炔-(1)基	氫	氫
Ar26	丙炔-(1)基	氟	氫
Ar27	丙炔-(1)基	氯	氫
Ar28	丙炔-(1)基	溴	氫
Ar29	丙炔-(1)基	碘	氫
Ar30	丙炔-(1)基	甲基	氫
Ar31	氯	氫	氟
Ar32	溴	氫	氟
Ar33	碘	氫	氟
Ar34	乙炔基	氫	氟
Ar35	丙炔-(1)基	氫	氟



	R''
Ar36	氫
Ar37	甲基



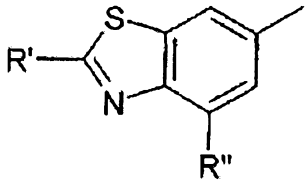
Ar38	氫
Ar39	甲基



	R'	R''	X
Ar40	氫	氫	氧
Ar41	氫	甲基	氧
Ar42	氫	溴	氧
Ar43	氫	氯	氧
Ar44	溴	氫	氧

Ar45	溴	甲 基	氧
Ar46	溴	氯	氧
Ar47	溴	溴	氧
Ar48	碘	氫	氧
Ar49	碘	甲 基	氧
Ar50	碘	氯	氧
Ar51	碘	溴	氧
Ar52	乙 炔 基	氫	氧
Ar53	乙 炔 基	甲 基	氧
Ar54	乙 炔 基	氯	氧
Ar55	乙 炔 基	溴	氧
Ar56	氫	氫	硫
Ar57	氫	甲 基	硫
Ar58	氫	溴	硫
Ar59	氫	氯	硫
Ar60	溴	氫	硫
Ar61	溴	甲 基	硫
Ar62	溴	氯	硫
Ar63	溴	溴	硫
Ar64	碘	氫	硫
Ar65	碘	甲 基	硫
Ar66	碘	氯	硫
Ar67	碘	溴	硫
Ar68	乙 炔 基	氫	硫

Ar69	乙炔基	甲基	硫
Ar70	乙炔基	氯	硫
Ar71	乙炔基	溴	硫



	R'	R''
Ar72	氢	氢
Ar73	氢	甲基
Ar74	氢	氯
Ar75	氢	溴
Ar76	甲基	氢
Ar77	甲基	甲基
Ar78	甲基	氯
Ar79	甲基	溴
Ar80	乙炔基	氢
Ar81	乙炔基	甲基
Ar82	乙炔基	氯
Ar83	乙炔基	溴

表 B：

定義為 S1 至 S4 之式 1a 之 R1

S1	SCH3
S2	OCH3
S3	CH2CH3
S4	SCH2CH3

表 C：

定義為 A1 至 A140 之式 1b 之 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$

	Ra	Rb	n	Rc	Rd	Re	R3
Ar1	甲基	甲基	0	—	—	氫	甲基
Ar2	甲基	甲基	0	—	—	氫	乙基
Ar3	甲基	甲基	0	—	—	氫	烯丙基
Ar4	甲基	甲基	0	—	—	氫	炔丙基
Ar5	甲基	甲基	0	—	—	氫	氫
Ar6	甲基	甲基	1	氫	氫	氫	甲基
Ar7	甲基	甲基	1	氫	氫	氫	乙基
Ar8	甲基	甲基	1	氫	氫	氫	烯丙基
Ar9	甲基	甲基	1	氫	氫	氫	炔丙基
Ar10	甲基	甲基	1	氫	氫	氫	氫
Ar11	甲基	甲基	0	—	—	甲基	甲基
Ar12	甲基	甲基	0	—	—	甲基	乙基
Ar13	甲基	甲基	0	—	—	甲基	烯丙基
Ar14	甲基	甲基	0	—	—	甲基	炔丙基
Ar15	甲基	甲基	0	—	—	甲基	氫

Ar16	甲基	甲基	1	氫	氫	甲基	甲基
Ar17	甲基	甲基	1	氫	氫	甲基	乙基
Ar18	甲基	甲基	1	氫	氫	甲基	烯丙基
Ar19	甲基	甲基	1	氫	氫	甲基	炔丙基
Ar20	甲基	甲基	1	氫	氫	甲基	氫
Ar21	甲基	乙炔基	0	—	—	氫	甲基
Ar22	甲基	乙炔基	0	—	—	氫	乙基
Ar23	甲基	乙炔基	0	—	—	氫	烯丙基
Ar24	甲基	乙炔基	0	—	—	氫	炔丙基
Ar25	甲基	乙炔基	0	—	—	氫	氫
Ar26	甲基	乙炔基	1	氫	氫	氫	甲基
Ar27	甲基	乙炔基	1	氫	氫	氫	乙基
Ar28	甲基	乙炔基	1	氫	氫	氫	烯丙基
Ar29	甲基	乙炔基	1	氫	氫	氫	炔丙基
Ar30	甲基	乙炔基	1	氫	氫	氫	氫
Ar31	甲基	乙炔基	0	—	—	甲基	甲基
Ar32	甲基	乙炔基	0	—	—	甲基	乙基
Ar33	甲基	乙炔基	0	—	—	甲基	烯丙基
Ar34	甲基	乙炔基	0	—	—	甲基	炔丙基
Ar35	甲基	乙炔基	0	—	—	甲基	氫
Ar36	甲基	乙炔基	1	氫	氫	甲基	甲基
Ar37	甲基	乙炔基	1	氫	氫	甲基	乙基
Ar38	甲基	乙炔基	1	氫	氫	甲基	烯丙基
Ar39	甲基	乙炔基	1	氫	氫	甲基	炔丙基
Ar40	甲基	乙炔基	1	氫	氫	甲基	氫

Ar41	甲基	CN	0	—	—	氫	甲基
Ar42	甲基	CN	0	—	—	氫	乙基
Ar43	甲基	CN	0	—	—	氫	烯丙基
Ar44	甲基	CN	0	—	—	氫	炔丙基
Ar45	甲基	CN	0	—	—	氫	氫
Ar46	甲基	CN	1	氫	氫	氫	甲基
Ar47	甲基	CN	1	氫	氫	氫	乙基
Ar48	甲基	CN	1	氫	氫	氫	烯丙基
Ar49	甲基	CN	1	氫	氫	氫	炔丙基
Ar50	甲基	CN	1	氫	氫	氫	氫
Ar51	甲基	CN	0	—	—	甲基	甲基
Ar52	甲基	CN	0	—	—	甲基	乙基
Ar53	甲基	CN	0	—	—	甲基	烯丙基
Ar54	甲基	CN	0	—	—	甲基	炔丙基
Ar55	甲基	CN	0	—	—	甲基	氫
Ar56	甲基	CN	1	氫	氫	甲基	甲基
Ar57	甲基	CN	1	氫	氫	甲基	乙基
Ar58	甲基	CN	1	氫	氫	甲基	烯丙基
Ar59	甲基	CN	1	氫	氫	甲基	炔丙基
Ar60	甲基	CN	1	氫	氫	甲基	氫
Ar61	甲基	CH ₂ F	0	—	—	氫	甲基
Ar62	甲基	CH ₂ F	0	—	—	氫	乙基
Ar63	甲基	CH ₂ F	0	—	—	氫	烯丙基
Ar64	甲基	CH ₂ F	0	—	—	氫	炔丙基
Ar65	甲基	CH ₂ F	0	—	—	氫	氫

Ar66	甲基	CH ₂ F	1	氫	氫	氫	甲基
Ar67	甲基	CH ₂ F	1	氫	氫	氫	乙基
Ar68	甲基	CH ₂ F	1	氫	氫	氫	烯丙基
Ar69	甲基	CH ₂ F	1	氫	氫	氫	炔丙基
Ar70	甲基	CH ₂ F	1	氫	氫	氫	氫
Ar71	甲基	CH ₂ F	0	—	—	甲基	甲基
Ar72	甲基	CH ₂ F	0	—	—	甲基	乙基
Ar73	甲基	CH ₂ F	0	—	—	甲基	烯丙基
Ar74	甲基	CH ₂ F	0	—	—	甲基	炔丙基
Ar75	甲基	CH ₂ F	0	—	—	甲基	氫
Ar76	甲基	CH ₂ F	1	氫	氫	甲基	甲基
Ar77	甲基	CH ₂ F	1	氫	氫	甲基	乙基
Ar78	甲基	CH ₂ F	1	氫	氫	甲基	烯丙基
Ar79	甲基	CH ₂ F	1	氫	氫	甲基	炔丙基
Ar80	甲基	CH ₂ F	1	氫	氫	甲基	氫
Ar81	甲基	CH ₂ O—甲基	0	—	—	氫	甲基
Ar82	甲基	CH ₂ O—甲基	0	—	—	氫	乙基
Ar83	甲基	CH ₂ O—甲基	0	—	—	氫	烯丙基
Ar84	甲基	CH ₂ O—甲基	0	—	—	氫	炔丙基
Ar85	甲基	CH ₂ O—甲基	0	—	—	氫	氫
Ar86	甲基	CH ₂ O—甲基	1	氫	氫	氫	甲基
Ar87	甲基	CH ₂ O—甲基	1	氫	氫	氫	乙基
Ar88	甲基	CH ₂ O—甲基	1	氫	氫	氫	烯丙基
Ar89	甲基	CH ₂ O—甲基	1	氫	氫	氫	炔丙基
Ar90	甲基	CH ₂ O—甲基	1	氫	氫	氫	氫

Ar91	甲基	CH ₂ O—甲基	0	—	—	甲基	甲基
Ar92	甲基	CH ₂ O—甲基	0	—	—	甲基	乙基
Ar93	甲基	CH ₂ O—甲基	0	—	—	甲基	烯丙基
Ar94	甲基	CH ₂ O—甲基	0	—	—	甲基	炔丙基
Ar95	甲基	CH ₂ O—甲基	0	—	—	甲基	氢
Ar96	甲基	CH ₂ O—甲基	1	氢	氢	甲基	甲基
Ar97	甲基	CH ₂ O—甲基	1	氢	氢	甲基	乙基
Ar98	甲基	CH ₂ O—甲基	1	氢	氢	甲基	烯丙基
Ar99	甲基	CH ₂ O—甲基	1	氢	氢	甲基	炔丙基
Ar100	甲基	CH ₂ O—甲基	1	氢	氢	甲基	氢
Ar101	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		0	—	—	氢	甲基
Ar102	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		0	—	—	氢	乙基
Ar103	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		0	—	—	氢	烯丙基
Ar104	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		0	—	—	氢	炔丙基
Ar105	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		0	—	—	氢	氢
Ar106	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		1	氢	氢	氢	甲基
Ar107	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		1	氢	氢	氢	乙基
Ar108	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		1	氢	氢	氢	烯丙基
Ar109	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		1	氢	氢	氢	炔丙基
Ar110	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		1	氢	氢	氢	氢
Ar111	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		0	—	—	甲基	甲基
Ar112	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		0	—	—	甲基	乙基
Ar113	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		0	—	—	甲基	烯丙基
Ar114	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		0	—	—	甲基	炔丙基
Ar115	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —		0	—	—	甲基	氢

Ar116	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	1	氫	氫	甲基	甲基
Ar117	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	1	氫	氫	甲基	乙基
Ar118	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	1	氫	氫	甲基	烯丙基
Ar119	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	1	氫	氫	甲基	炔丙基
Ar120	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	1	氫	氫	甲基	氫
Ar121	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	0	—	—	氫	甲基
Ar122	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	0	—	—	氫	乙基
Ar123	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	0	—	—	氫	烯丙基
Ar124	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	0	—	—	氫	炔丙基
Ar125	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	0	—	—	氫	氫
Ar126	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	1	氫	氫	氫	甲基
Ar127	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	1	氫	氫	氫	乙基
Ar128	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	1	氫	氫	氫	烯丙基
Ar129	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	1	氫	氫	氫	炔丙基
Ar130	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	1	氫	氫	氫	氫
Ar131	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	0	—	—	甲基	甲基
Ar132	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	0	—	—	甲基	乙基
Ar133	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	0	—	—	甲基	烯丙基
Ar134	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	0	—	—	甲基	炔丙基
Ar135	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	0	—	—	甲基	氫
Ar136	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	1	氫	氫	甲基	甲基
Ar137	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	1	氫	氫	甲基	乙基
Ar138	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	1	氫	氫	甲基	烯丙基
Ar139	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	1	氫	氫	甲基	炔丙基
Ar140	—CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ —	1	氫	氫	甲基	氫

表 1

表 1 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar1，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 2

表 2 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar1，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 3

表 3 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar1，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 4

表 4 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar1，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 5

表 5 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar2，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 6

表 6 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar2，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 7

表 7 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar2，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 8

表 8 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar2，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 9

表 9 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar3，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 10

表 10 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar3，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 11

表 11 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar3，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 12

表 12 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar3，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 13

表 13 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar4，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 14

表 14 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar4，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 15

表 15 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar4，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 16

表 16 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar4，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 17

表 17 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar5，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 18

表 18 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar5，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 19

表 19 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar5，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 20

表 20 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar5，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 21

表 21 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar6，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 22

表 22 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar6，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 23

表 23 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar6，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 24

表 24 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar6，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 25

表 25 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar7，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 26

表 26 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar7，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 27

表 27 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar7，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 28

表 28 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar7，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 29

表 29 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar8，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 30

表 30 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar8，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 31

表 31 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar8，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 32

表 32 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar8，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 33

表 33 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar9，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 34

表 34 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar9，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 35

表 35 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar9，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 36

表 36 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar9，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 37

表 37 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar10，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 38

表 38 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar10，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 39

表 39 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar10，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 40

表 40 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar10，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 41

表 41 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar11，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 42

表 42 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar11，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 43

表 43 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar11，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 44

表 44 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar11，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 45

表 45 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar12，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 46

表 46 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar12，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 47

表 47 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar12，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 48

表 48 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar12，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 49

表 49 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar13，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 50

表 50 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar13，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 51

表 51 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar13，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 52

表 52 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar13，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 53

表 53 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar14，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 54

表 54 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar14，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 55

表 55 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar14，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 56

表 56 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar14，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 57

表 57 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar15，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 58

表 58 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar15，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 59

表 59 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar15，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 60

表 60 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar15，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 61

表 61 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar16，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 62

表 62 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar16，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 63

表 63 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar16，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 64

表 64 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar16，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 65

表 65 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar17，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 66

表 66 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar17，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 67

表 67 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar17，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 68

表 68 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar17，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 69

表 69 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar18，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 70

表 70 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar18，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 71

表 71 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar18，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 72

表 72 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar18，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 73

表 73 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar19，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 74

表 74 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar19，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 75

表 75 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar19，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 76

表 76 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar19，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 77

表 77 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar20，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 78

表 78 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar20，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 79

表 79 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar20，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 80

表 80 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar20，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 81

表 81 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar21，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 82

表 82 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar21，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 83

表 83 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar21，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 84

表 84 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar21，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 85

表 85 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar22，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 86

表 86 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar22，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 87

表 87 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar22，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 88

表 88 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar22，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 89

表 89 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar23，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 90

表 90 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar23，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 91

表 91 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar23，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 92

表 92 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar23，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 93

表 93 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar24，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 94

表 94 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar24，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 95

表 95 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar24，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 96

表 96 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar24，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 97

表 97 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar25，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 98

表 98 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar25，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 99

表 99 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar25，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 100

表 100 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar25，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 101

表 101 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar26，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 102

表 102 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar26，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 103

表 103 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar26，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 104

表 104 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar26，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 105

表 105 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar27，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 106

表 106 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar27，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 107

表 107 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar27，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 108

表 108 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar27，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 109

表 109 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar28，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 110

表 110 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar28，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 111

表 111 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar28，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 112

表 112 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar28，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 113

表 113 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar29，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 114

表 114 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar29，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 115

表 115 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar29，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 116

表 116 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar29，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 117

表 117 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar30，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 118

表 118 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar30，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 119

表 119 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar30，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 120

表 120 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar30，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 120

表 120 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar31，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 123

表 123 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar31，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 124

表 124 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar32，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 125

表 125 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar32，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 127

表 127 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar33，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 128

表 128 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar33，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 131

表 131 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar34，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 132

表 132 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar34，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 135

表 135 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar35，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 136

表 136 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar35，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 138

表 138 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar36，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 139

表 139 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar36，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 140

表 140 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar36，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 141

表 141 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar36，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 142

表 142 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar37，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 143

表 143 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar37，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 144

表 144 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar37，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 145

表 145 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar37，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 146

表 146 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar38，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 147

表 147 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar38，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 148

表 148 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar38，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 149

表 149 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar38，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 150

表 150 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar39，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 151

表 151 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar39，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 152

表 152 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar39，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 153

表 153 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar39，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 154

表 154 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar40，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 155

表 155 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar40，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 156

表 156 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar40，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 157

表 157 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar40，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 158

表 158 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar41，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 159

表 159 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar41，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 160

表 160 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar41，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 161

表 161 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar41，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 162

表 162 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar42，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 163

表 163 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar42，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 164

表 164 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar42，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 165

表 165 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar42，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 166

表 166 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar43，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 167

表 167 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar43，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 168

表 168 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar43，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 169

表 169 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar43，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 170

表 170 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar44，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 171

表 171 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar44，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 172

表 172 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar44，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 173

表 173 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar44，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 174

表 174 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar45，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 175

表 175 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar45，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 176

表 176 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar45，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 177

表 177 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar45，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 178

表 178 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar46，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 179

表 179 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar46，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 180

表 180 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar46，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 181

表 181 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar46，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 182

表 182 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar47，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 183

表 183 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar47，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 184

表 184 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar47，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 185

表 185 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar47，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 186

表 186 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar48，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 187

表 187 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar48，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 188

表 188 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar48，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 189

表 189 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar48，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 190

表 190 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar49，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 191

表 191 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar49，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 192

表 192 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar49，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 193

表 193 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar49，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 194

表 194 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar50，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 195

表 195 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar50，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 196

表 196 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar50，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 197

表 197 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar50，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 198

表 198 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar51，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 199

表 199 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar51，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 200

表 200 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar51，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 201

表 201 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar51，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 202

表 202 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar52，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 203

表 203 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar52，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 204

表 204 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar52，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 205

表 205 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar52，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 206

表 206 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar53，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 207

表 207 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar53，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 208

表 208 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar53，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 209

表 209 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar53，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 210

表 210 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar54，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 211

表 211 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar54，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 212

表 212 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar54，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 213

表 213 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar54，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 214

表 214 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar55，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 215

表 215 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar55，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 216

表 216 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar55，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 217

表 217 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar55，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 218

表 218 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar56，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 219

表 219 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar56，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 220

表 220 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar56，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 221

表 221 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar56，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 222

表 222 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar57，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 223

表 223 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar57，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 224

表 224 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar57，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 225

表 225 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar57，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 226

表 226 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar58，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 227

表 227 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar58，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 228

表 228 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar58，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 229

表 229 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar58，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 230

表 230 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar59，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 231

表 232 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar59，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 232

表 232 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar59，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 233

表 233 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar59，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 234

表 234 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar60，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 235

表 235 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar60，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 236

表 236 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar60，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 237

表 237 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar60，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 238

表 238 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar61，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 239

表 239 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar61，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 240

表 240 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar61，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 241

表 241 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar61，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 242

表 242 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar62，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 243

表 243 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar62，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 244

表 244 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar62，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 245

表 245 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar62，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 246

表 246 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar63，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 247

表 247 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar63，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 248

表 248 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar63，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 249

表 249 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar63，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 250

表 250 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar64，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 251

表 251 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar64，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 252

表 252 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar64，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 253

表 253 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar64，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 254

表 254 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar65，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 255

表 255 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar65，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 256

表 256 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar65，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 257

表 257 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar65，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 258

表 258 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar66，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 259

表 259 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar66，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 260

表 260 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar66，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 261

表 261 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar66，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 262

表 262 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar67，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 263

表 263 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar67，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 264

表 264 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar67，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 265

表 265 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar67，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 266

表 266 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar68，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 267

表 267 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar68，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 268

表 268 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar68，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 269

表 269 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar68，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 270

表 270 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar69，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 271

表 271 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar69，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 272

表 272 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar69，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 273

表 273 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar69，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 274

表 274 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar70，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 275

表 275 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar70，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 276

表 276 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar70，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 277

表 277 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar70，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 278

表 278 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar71，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 279

表 279 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar71，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 280

表 280 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar71，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 281

表 281 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar71，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 282

表 282 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar72，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 283

表 283 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar72，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 284

表 284 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar72，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 285

表 285 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar72，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 286

表 286 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar73，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 287

表 287 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar73，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 288

表 288 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar73，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 289

表 289 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar73，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 290

表 290 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar74，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 291

表 291 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar74，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 292

表 292 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar74，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 293

表 293 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar74，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 294

表 294 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar75，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 295

表 295 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar75，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 296

表 296 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar75，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 297

表 297 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar75，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 298

表 298 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar76，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 299

表 299 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar76，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 300

表 300 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar76，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 301

表 301 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar76，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 302

表 302 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar77，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 303

表 303 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar77，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 304

表 304 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar77，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 305

表 305 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar77，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 306

表 306 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar78，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 307

表 307 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar78，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 308

表 308 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar78，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 309

表 309 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar78，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 310

表 310 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar79，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 311

表 311 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar79，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 312

表 312 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar79，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 313

表 313 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar79，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 314

表 314 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar80，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 315

表 315 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar80，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 316

表 316 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar80，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 317

表 317 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar80，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 318

表 318 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar81，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 319

表 319 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar81，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 320

表 320 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar81，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 321

表 321 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar81，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 322

表 322 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar82，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 323

表 323 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar82，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 324

表 324 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar82，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 325

表 325 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar82，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e=N-OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 326

表 326 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar83，R1 為表 B 之 S1，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 327

表 327 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar83，R1 為表 B 之 S2，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 328

表 328 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar83，R1 為表 B 之 S3，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

表 329

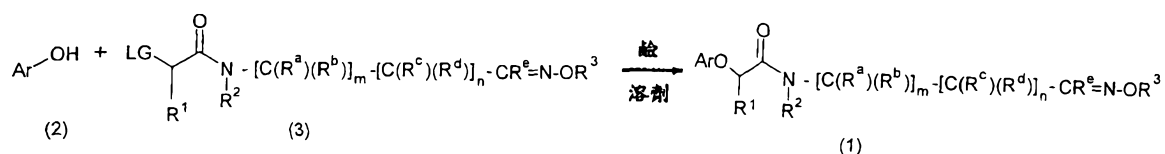
表 329 包含式 1a 化合物，其 Ar 為表 A 之 Ar83，R1 為表 B 之 S4，以及 $-[C(R^a)(R^b)]_m - [C(R^c)(R^d)]_n - CR^e = N - OR^3$ 為表 C 之 A1 至 A140。

可如下文流程 1 至 17 所概括製備通式 (1) 之化合物，其中 Ar，R¹，R²，R^a，R^b，R^c，R^d，R^e，R³，m 和 n 具有上文所給含義，且 L 為 O，除非本文另有指示。如流程 1 所示，可藉由在鹼存在下在適當溶劑中使通式 (2) 之化合物與通式 (3) 之化合物反應製備通式 (1) 之化合物。典型溶劑包括 *N,N*-二甲基甲醯胺及 *N*-甲基吡咯啉-2-酮。適當鹼包括碳酸鉀、氫化鈉或二異丙基乙基胺。

某些中間物和起始材料為習知化合物且已商業販售，

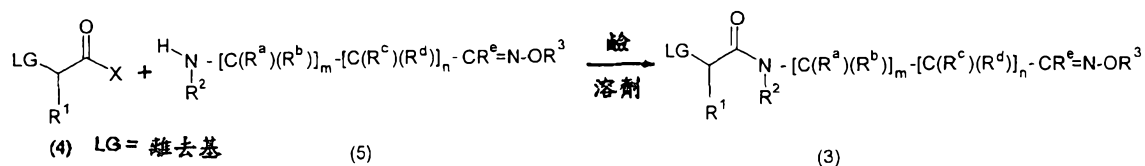
或者可根據為此技藝人士習知的程序加以製備。值得注意每一種轉化之箭頭之簡單敘述僅為例示目的，且應該不被視為限定其順序或每一個別步驟。

流程 1



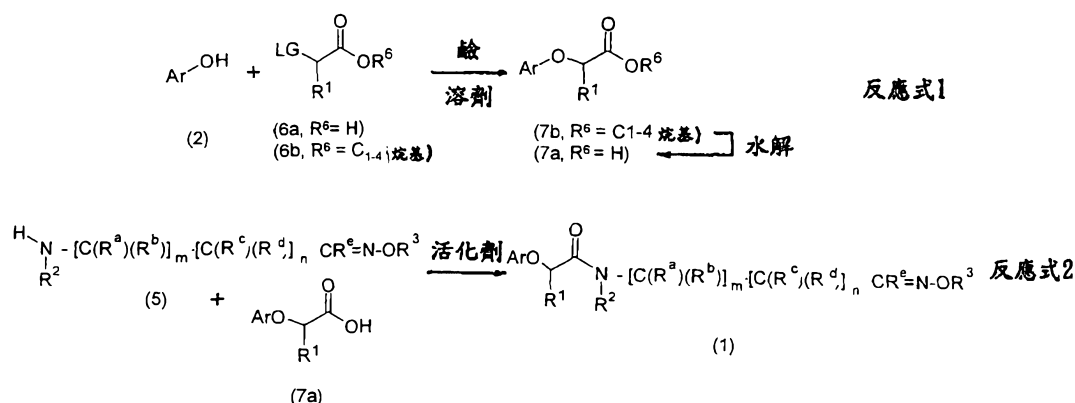
如流程 2 所示，可藉由在諸如碳酸鉀或二異丙基乙基胺之適當無機或有機鹼存在下，在諸如二氯甲烷、四氫呋喃或 N,N-二甲基甲醯胺之溶劑中使通式 (5) 之胺與諸如酸鹵化物之活化羧酸或通式 (4) 之相應酸酐反應製備通式 (3) 之化合物。

流程 2



或者如流程 3 所示，可藉由使用諸如 1-羥基苯并三唑 (HOBt)、(苯并三唑-1-基氧基)-參-(二甲基胺基)-磷-六氟磷酸鹽 (BOP)、1-羥基-7-氮雜苯并三唑 (HOAT) 或 N-(3-二甲基胺基-丙基)-N'-乙基-碳化二亞胺鹽酸鹽 (EDC) 之適當活化劑使通式 (7a) (其中 R₆ 為氫) 之化合物與通式 (5) 之胺縮合製備通式 (1) 之化合物。

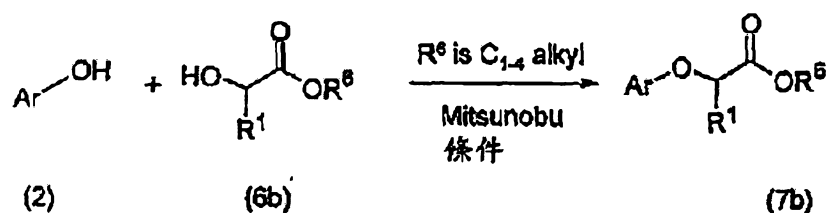
流程 3



可經由如流程 3 所示 R_6 為 C_{1-4} 烷基之通式 (7b) 之化合物的中介環節製備通式 (1) 之化合物。可藉由在諸如碳酸鉀或氫化鈉之適當鹼存在下，在諸如 N,N -二甲基甲醯胺之適當溶劑中使通式 (2) 之化合物與通式 (分別 6a 或 6b) 之酯或酸反應製備 R_6 為 C_{1-4} 烷基以及亦為通式 (7a) 之酸之通式 (7b) 之酯。可購得或可藉由標準文獻方法自市售材料製備分別為通式 (6a) 及 (6b) 之酯或酸。

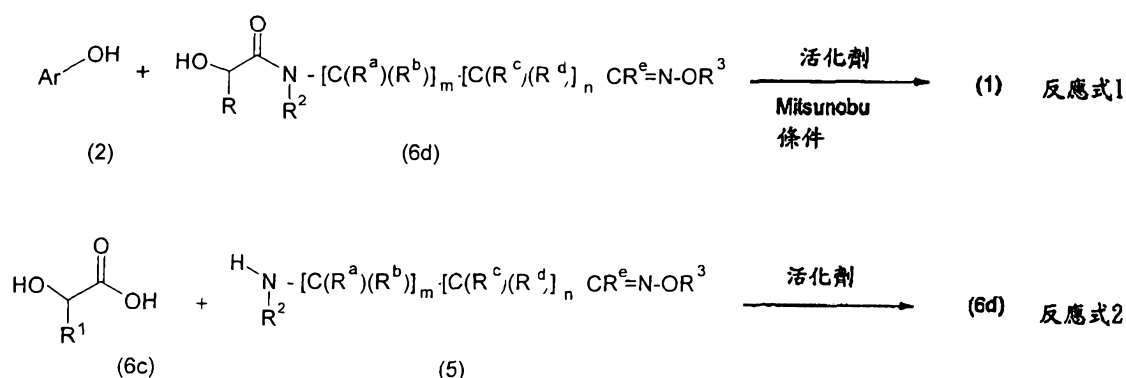
或者，如流程 4 所示，可在 Mitsunobu 條件下藉由使用諸如三苯基磷之磷及諸如偶氮二甲酸二乙酯之偶氮酯，使通式 (2) 之化合物與 R_6 為 C_{1-4} 烷基之通式 (6b) 之化合物反應製備通式 (7b) 之化合物。

流程 4



如流程 5 所示，在另一製備通式 (1) 之化合物之方法中，可在 Mitsunobu 條件下使用諸如三苯基膦之膦及諸如偶氮二甲酸二乙酯之偶氮酯使通式 (6d) 之化合物與通式 (2) 之化合物反應。可使用諸如 1-羥基苯并三唑及 N-(3-二甲基胺基丙基)-N'-乙基-碳化二亞胺鹽酸鹽之適當活化劑，由通式 (6c) 之化合物及通式 (5) 之胺製備通式 (6d) 之化合物。

流程 5

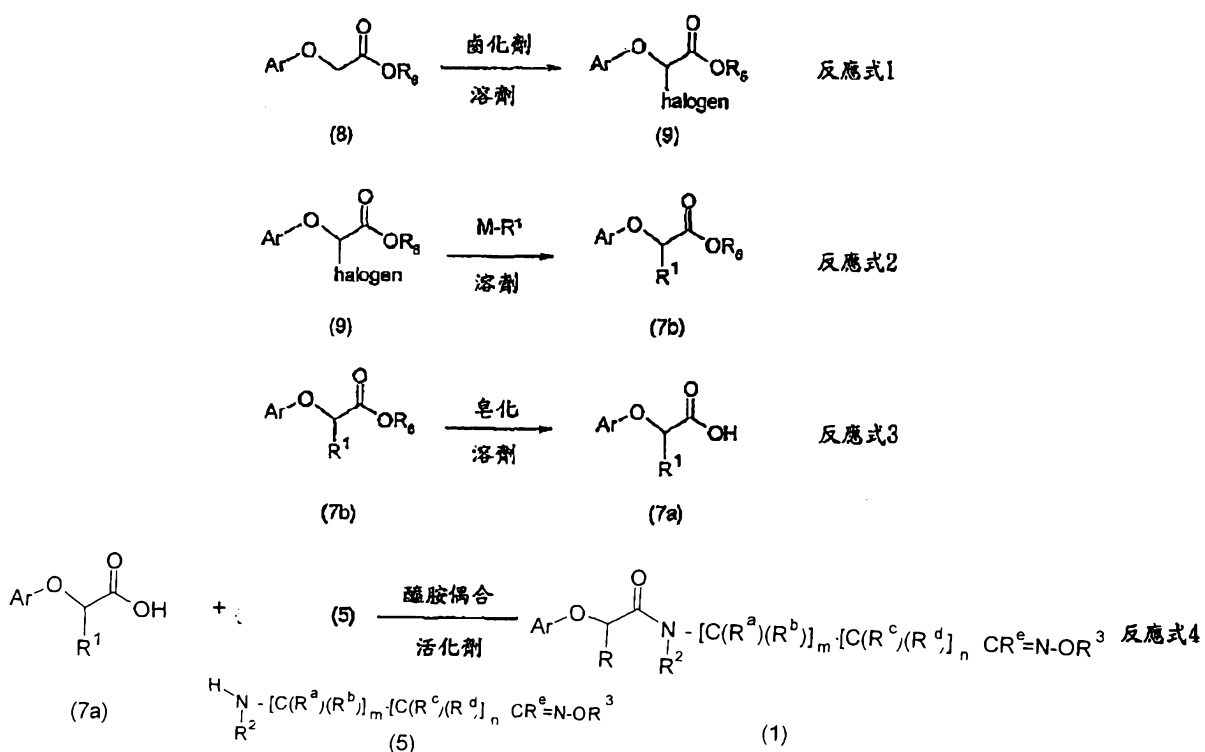


通式 (6c) 及 (6c) 之化合物為已知化合物或可由市售及/或已知化合物根據熟習此項技術者已知之方法製備。

另外，可如流程 6 所示製備如申請專利範圍第 1 項所定義之 R1 之通式 (1) 之化合物。因此，可藉由在諸如四氯化碳之適當溶劑中在環境溫度與溶劑之回流溫度之間，以諸如 N-溴代丁二醯亞胺之適當鹵化劑處理，將式 (8) 之酯鹵化以提供通式 (9) 之鹵代酯。通式 (9) 之鹵代酯可在 0°C 和 60°C 之間，較佳在環境溫度下，與在作為溶劑之例如醇 R₁OH 或硫醇 R₁SH 中的鹼金屬化合物 M⁺OR₁ 或 M⁺SR₁ (其中 M 為合適的鈉或鉀) 反應而製得通式 (7b) 的化合

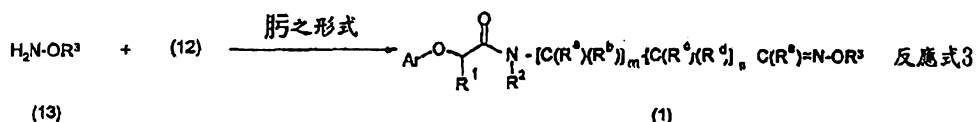
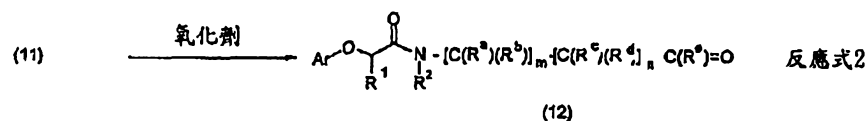
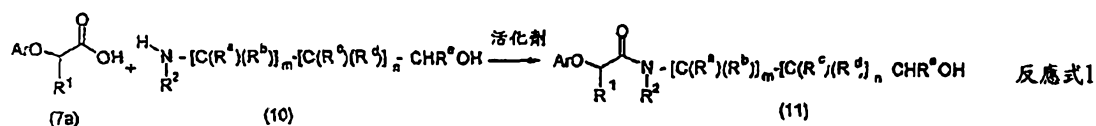
物。在水性醇 R_1OH 中，在環境溫度與回流溫度之間，使酯 (7b) 經鹼金屬氧氧化物例如氫氧化鈉處理而被水解成為通式 (7a) 之酸。可使用諸如 1-羥基苯并三唑及 N-(3-二甲基胺基丙基)-N'-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽之適當活化試劑使通式 (7a) 之羧酸與通式 (5) 之胺縮合以提供通式 (1) 之化合物，其中 m 為 1 且 R_1 如上文所定義。

流程 6



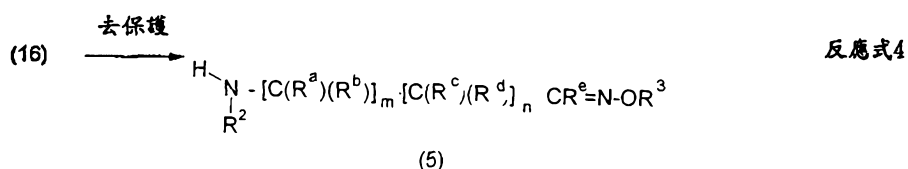
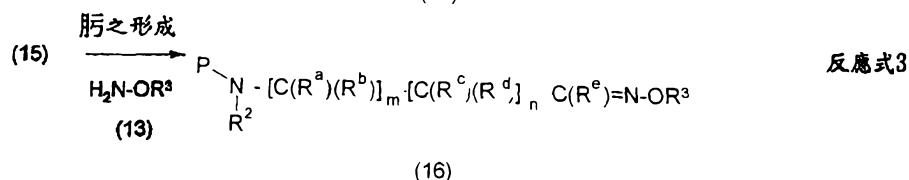
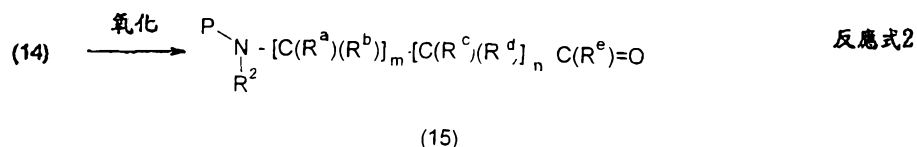
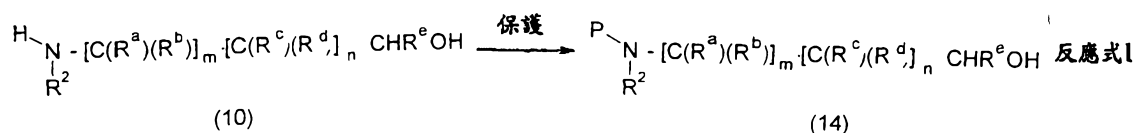
或者，如流程 7 所示，通式 (1) 化合物可經由通式 (7a) 之酸之中間法而製備，其係使其與通式 (10) 之化合物反應而得到通式 (11) 之羥基醯胺。在合適氧化劑例如 DessMartin 戴斯-馬丁高碘烷存在下，(11) 的氧化，接著使所得到羰基衍生物 (12) 與通式 (13) 之羥基胺或其鹽反應，將會得到通式 (1) 之化合物。

流程 7



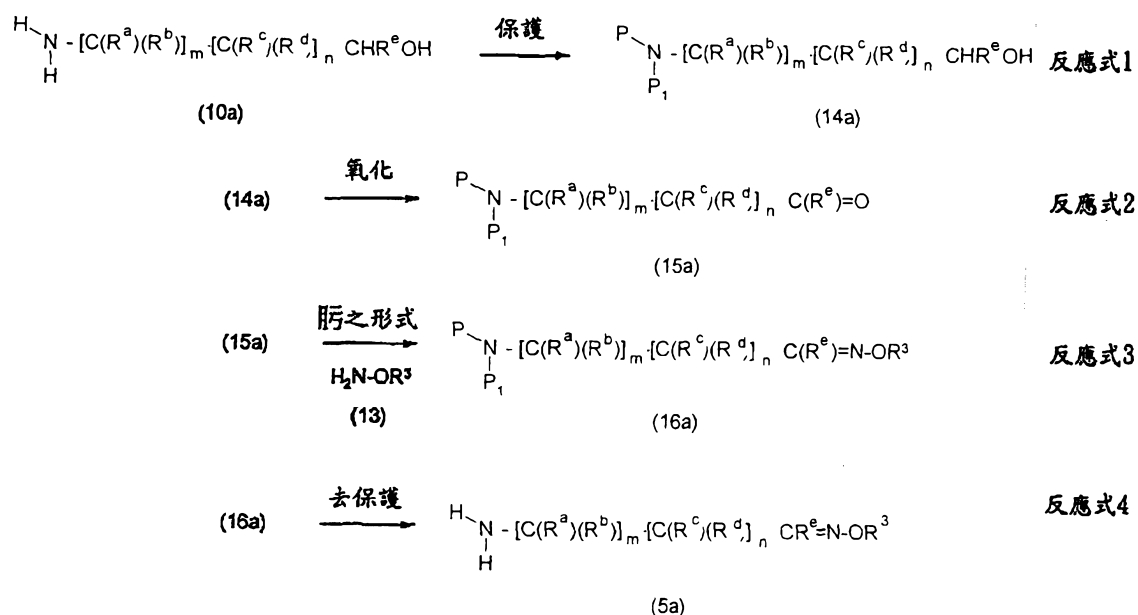
可如流程 8 所示，通式 (5) 之胺化合物可製備於使通式 (10) 之羥基胺之胺官能基之保護而得到通式 (14) 之化合物 (其中 P 代表氮保護基例如三級-丁氧基羰基 (Boc)，乙醯基 (Ac)，三氟乙醯基，苄基氧基羰基 (Cbz))，接著使其與合適的氧化劑例如三氧化硫吡啶錯合物在二甲基亞碸中反應，而成氧化的通式 (15) 化合物。此通式 (15) 的羰基衍生物可與通式 (13) 之羥基胺反應，而製得通式 (16) 之胺基-保護羥基胺。通式 (16) 之胺基之去保護提供通式 (5) 之胺，其意謂亦包括其鹽。

流程 8



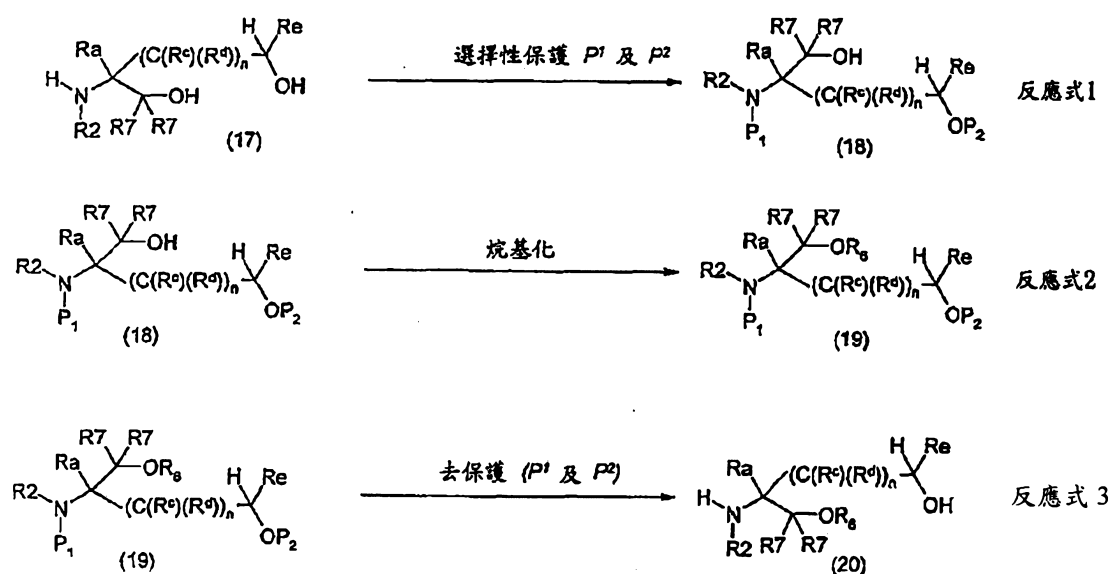
或者，如流程 9 所示，通式(5a)化合物(其代表通式(5)化合物中 R^2 為氫)可製備於使通式(10a)之羥基胺之胺基官能基之保護作用而得到通式(14a)之化合物(其中 P 和 P1 獨立地代表氮保護基例如三級-丁氧基羰基(Boc)，乙醯基(Ac)，三氟乙醯基，苄基氧基羰基(Cbz)，烯丙基氧基羰基(Aloc)，貝他(三甲基矽烷基)-乙烷磺醯基(SES)或氫。或者，其中 P 和 P1 不為氫者，其亦可一起形成環式保護基例如酞醯亞胺(Pht)。(14a)與合適的氧化劑例如三氧化硫-吡啶錯合物在二甲基亞碲反應，提供通式(15a)之氧化化合物。此通式(15a)之羰基衍生物可與通式(13)之羥基胺反應而提供通式(16a)之胺基-保護肼。式(16)之胺基之去保護提供通式(5a)之胺基-肼，其意謂亦包括其鹽。

流程 9



如流程 10 所例示者，通式(20)之烷氧基－，烯氧基－和炔氧基－烷基胺，其中 R^6 為 C_{1-4} 烷基， C_{3-5} 烯基， C_{3-5} 炔基，可用於製備通式(1)之 oximino，如流程 11 所示者，可經由保護、烷基化和去保護順序而加以製備。

流程 10



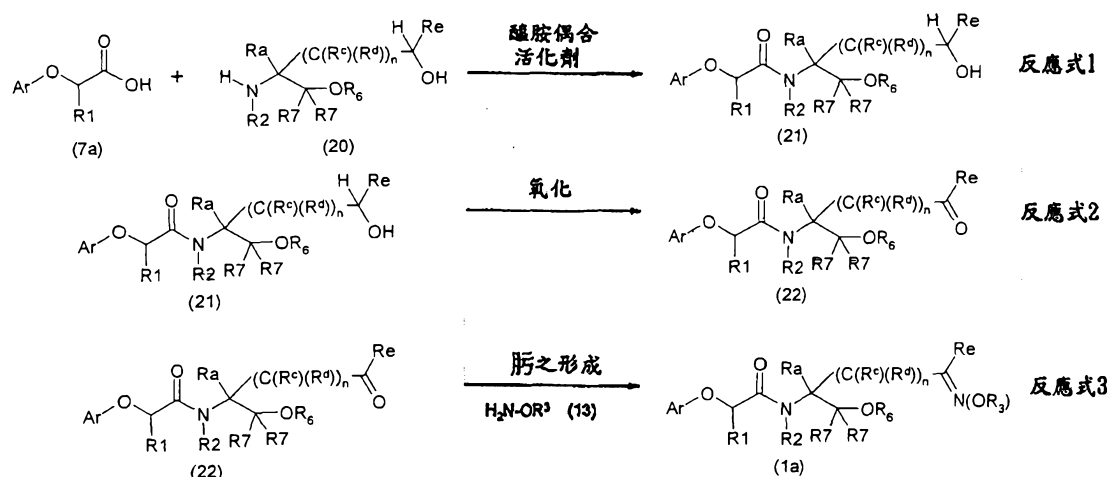
其中 R^6 獨立地為 C_{1-4} 烷基， C_{3-5} 烯基， C_{3-5} 炔基

R^7 獨立地為 H， C_{1-4} 烷基

P^1 及 P^2 為可被連接在一起的獨立保護基

如流程 11 所例示者，通式(1a)之化合物可經由通式(7a)之酸之反應，藉由使其通式(20)之化合物反應(流程 11，反應式 1)而製得通式(21)的羥基醯胺。氧化反應(21)之後，接著使羰基衍生物(22)與通式(13)化合物或其鹽類反應，然後提供式(1a)化合物，其係為通式(1)化合物其中 L 為氧且 R^b 為羥基－(C_{1-4})烷基， C_{1-4} 烷氧基－(C_{1-4})烷基， C_{3-5} 烯氧基－(C_{1-4})烷基或 C_{3-5} 炔氧基－(C_{1-4})烷基之實例。

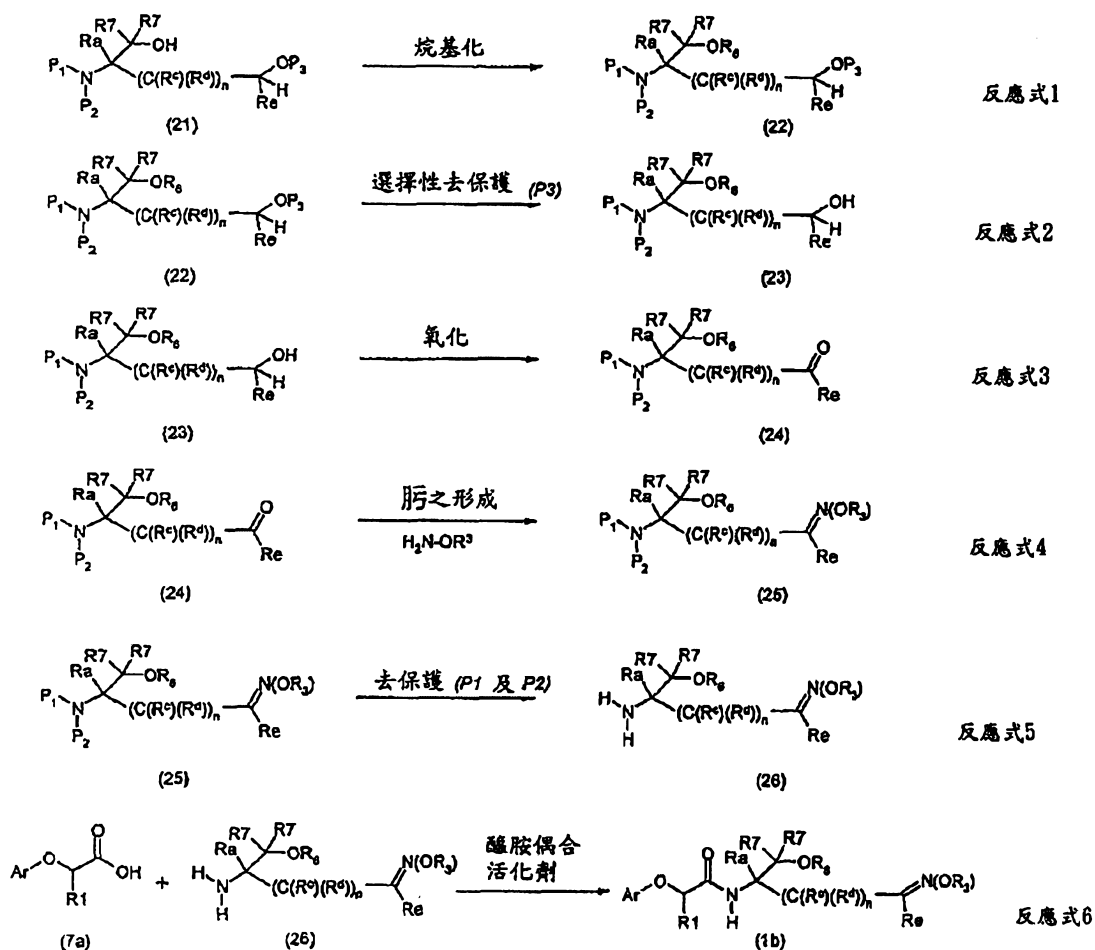
流程 11



其中 R^5 獨立地為 H, C_{1-4} 烷基, C_{2-4} 烯基, C_{2-4} 炔基
 R^7 獨立地為 H, C_{1-4} 烷基

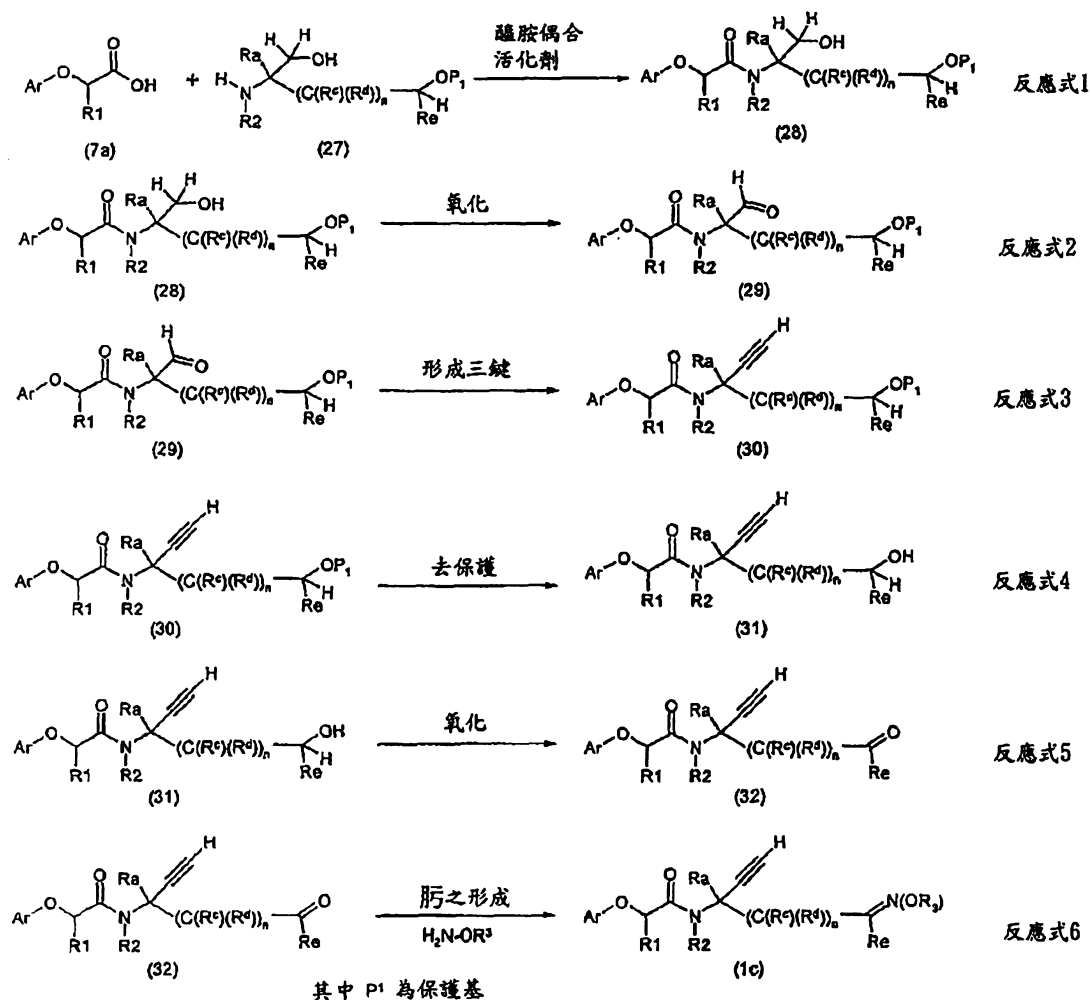
或者，如流程 12，反應式 5 所例示者，通式(1b)之化合物(通式(1)化合物，其中 L 為氧且 R^b 為 C_{1-4} 烷氧基—(C_{1-4})烷基， C_{3-5} 烯氧基—(C_{1-4})烷基或 C_{3-5} 炔氧基—(C_{1-4})烷基)，可直接製備於以通式(26)之胺偶合通式(7a)之羧酸。胺(26)(其係為通式(5)，其中 R^b 為 C_{1-4} 烷氧基—(C_{1-4})烷基， C_{3-5} 烯氧基—(C_{1-4})烷基或 C_{3-5} 炔氧基—(C_{1-4})烷基之實例)可依流程 12 反應 1 至 5 所示者加以製備。

流程 12



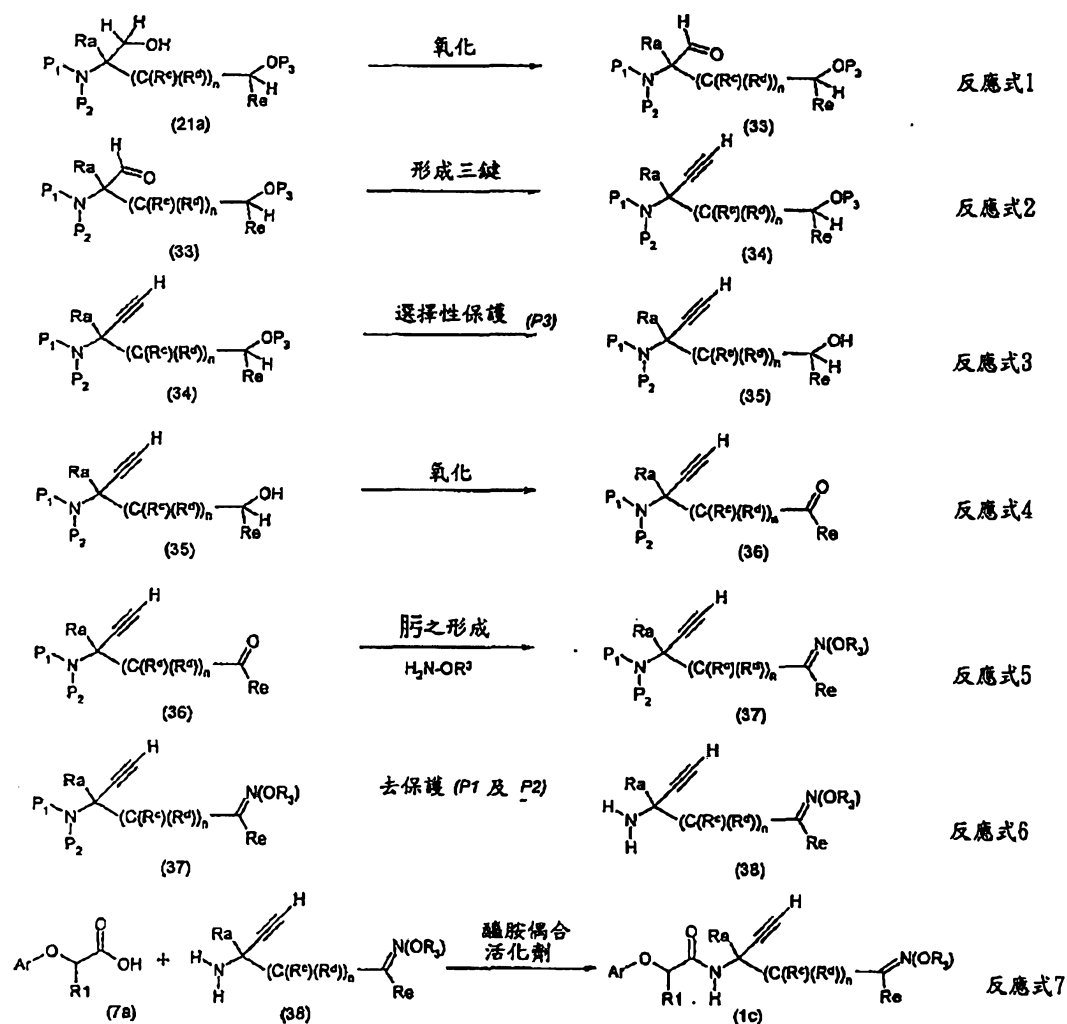
通式 (1c) 化合物 (其係為通式 (1) 化合物中 R^b 為乙炔基之實例) 可以如流程 13 所例示之為此技藝人士所習知的六道合成步驟而製備於通式 (7a) 之酸。

流程 13



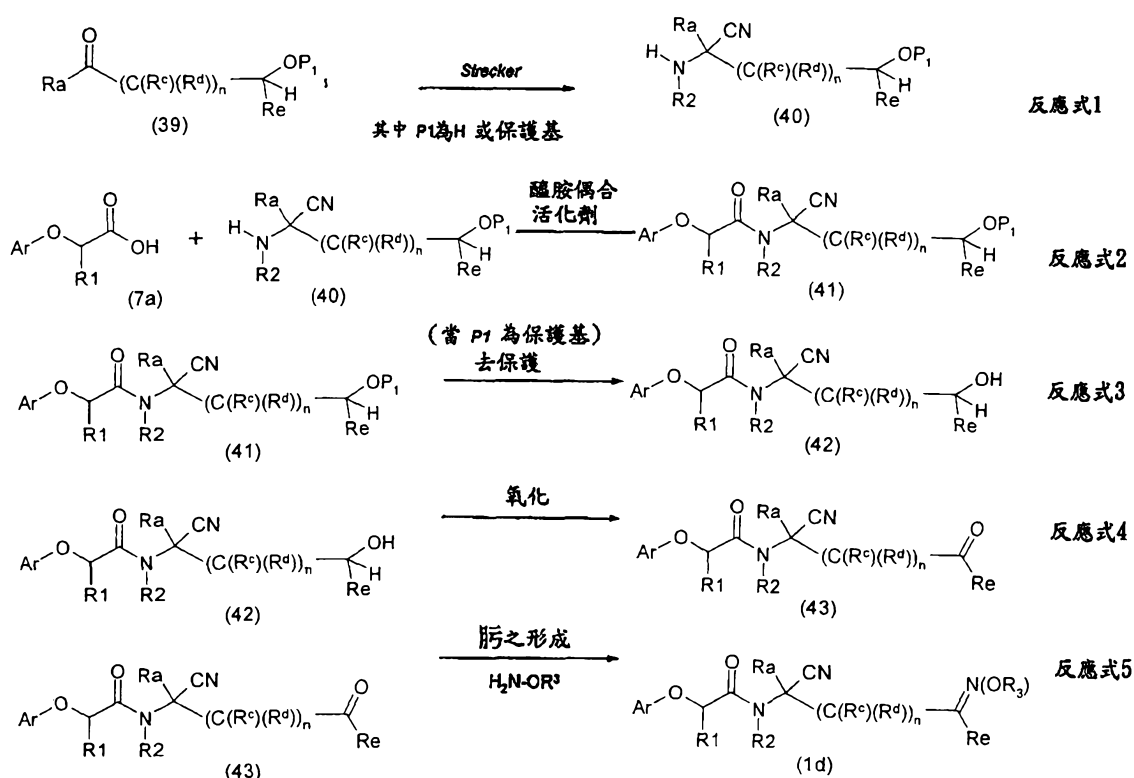
或者，如流程 14 反應式 7 所例示者，通式(1c)化合物可以通式(38)之胺直接偶合通式(7a)之羧酸而製備。胺(38)，其係為通式(5)胺(其中 R^b 為乙烯基)之實例，可以如流程 14 反應式 1 至 6 所例示之為此技藝人士所習知的六道合成步驟加以製備。

流程 14



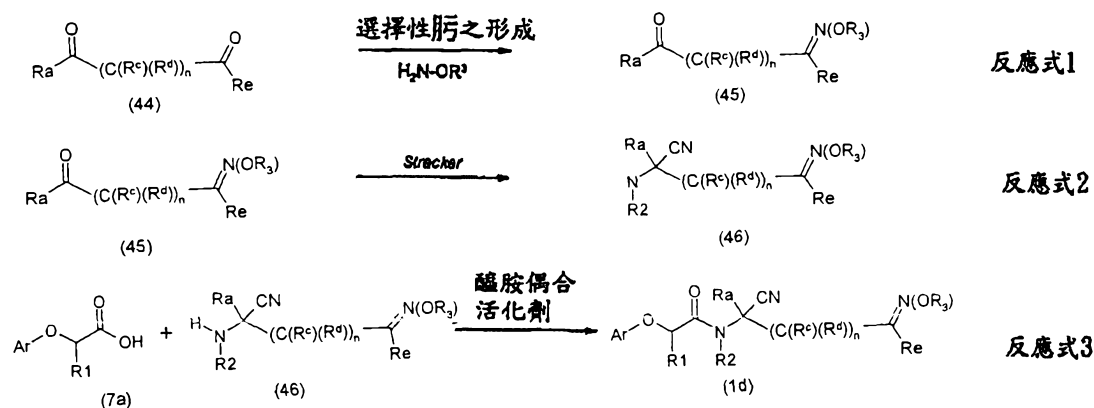
如流程 15 所例示者，通式(1d)化合物(其係為通式(1)化合物中 R^b 為氰基之實例)，可以為此技藝人士所習知的四道合成步驟加以製備。

流程 15



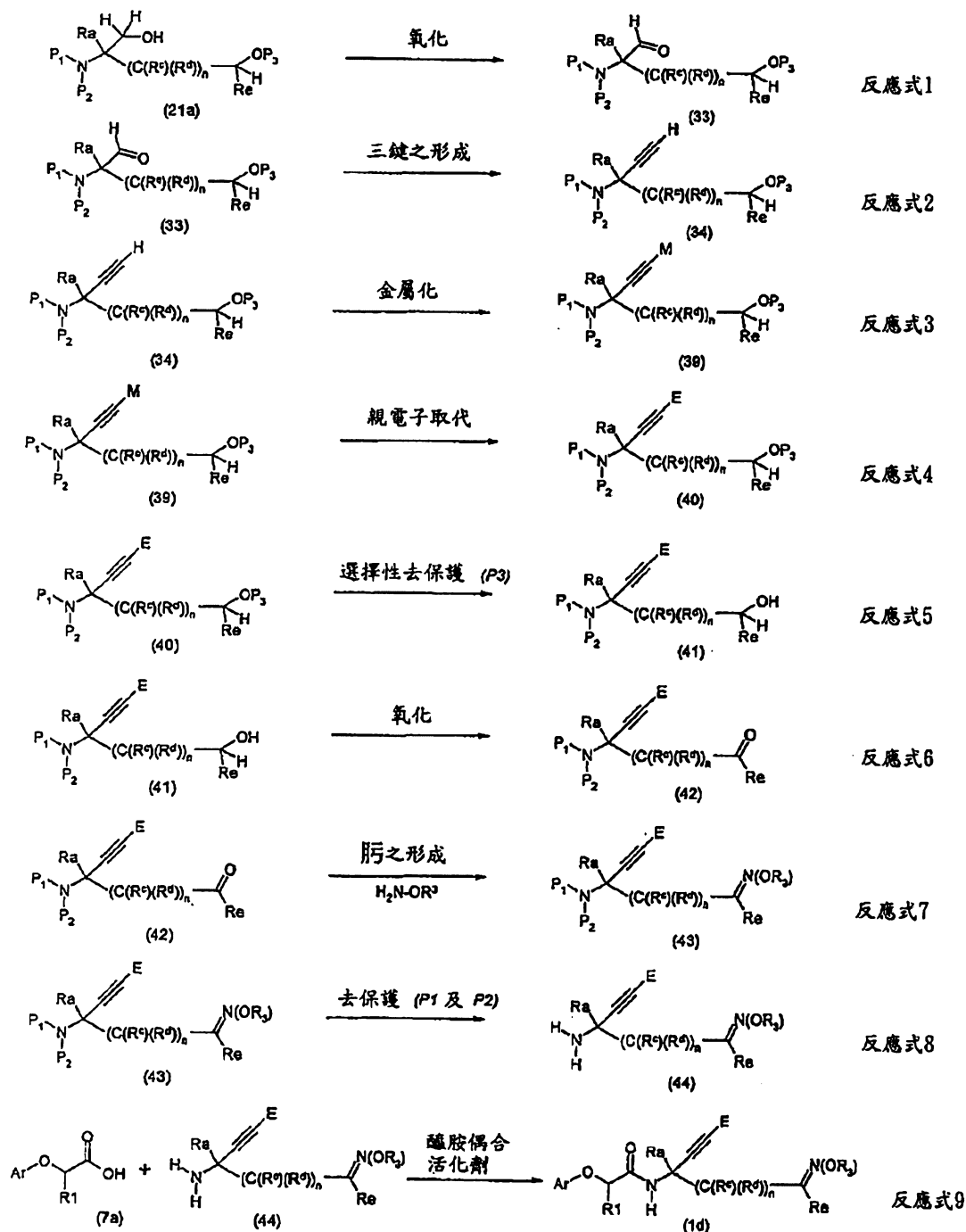
或者，如流程 16 反應式 3 所例示者，通式(1d)化合物可以通式(46)之胺直接偶合通式(7a)之羧酸而製備。胺(46)，其係為通式(5)胺(其中 R^b 為氰基)之實例，可以如流程 16 反應式 1 至 2 所例示之為此技藝人士所習知者加以製備。

流程 16



通式(1e)化合物，其中 R^b 為 C_{1-3} 烷氧基-(C_{1-3})烷基
(C_{1-3})炔基， C_{1-3} 烯基氧基(C_{1-3})烷基(C_{1-3})炔基， C_{1-3} 炔
基氧基(C_{1-3})烷基(C_{1-3})炔基者，可以如流程 x，反應式 1
至 9 所例示之為此技藝人士所習知者加以製備。

流程 17



其中 P_1, P_3 為獨立保護基； P_2 為 R^2 或保護基；E 為 C_{1-4} 烷基, C_{1-4} 烷氧基, C_{1-4} 羥基烷基

本發明其他化合物可使用為此技藝人士習知程序藉由將通式(1)化合物的取代基予以轉化而製備。因此，式(1)化合物可根據習知官能基轉換藉由將某些式(1)化合物互相轉換。例如，通式(1)化合物(其中 R^3 為氫)可被烷基化成為通式(1)的肟(其中 R^3 為 C_{1-3} 烷基)，其係在合適溶劑例如乙腈、在環境溫度和溶劑回流溫度之間、藉由以合適的烷基化劑例如碘乙烷處理之下製備。再者，通式(1)化合物(其中芳基部分(Ar)被鹵素例如溴或碘取代)可在使用為此技藝人士所習知的過渡金屬(例如鈀(0))觸媒化乙烯基化和炔基化反應(例如 Heck, Stille, Sonogashira)之下被轉換成為另外的通式(1)化合物(其中芳基部分(Ar)之鹵素取代基被 C_{2-4} 烯基(例如乙烯基)或 C_{2-4} 炔基(例如乙炔基，丙炔-1-基)取代)。再者，此類通式(1)化合物(其中芳基部分(Ar)之鹵素取代基被 C_{2-4} 烯基(例如乙烯基)或 C_{2-4} 炔基(例如乙炔基，丙炔-1-基)取代)可在使用上述過渡金屬-媒介烯基化或炔基化反應，接著使用為此技藝人士所習知的例行官能基操作，間接自通式(7b 反應式 3)化合物製備。

通式(2)之羥基(雜)芳基 $ArOH$ 係為已商品化或者可藉由為此技藝人士所習知的標準文獻(例如參見 Ann. Chem., Justus Liebig's (1966), 98-106, 其係用於合成用於製備部分列於表 25 至 28 之化合物的 3-溴-6-羥基喹啉; Synthetic Communications (1991), 21(7), 959-64, 其係用於合成用於製備部分列於表 218 至 221 之化合物的苯並[b]噻吩-5-醇; Synthetic Communications (2006), 36(14),

1983—1990，其係用於合成用於製備列於表 154 至 157 之化合物的苯並呋喃—5—醇，以及 European Journal of Organic Chemistry (2000), (3), 491—497，其係用合成 7—溴—萘—2—醇，參見以下實施例 12，13，14，15，16，17 和 18 用於製備額外的代表性羥基(雜)芳基(ArOH)。

通式(6)的酸酯已商品化或者可藉標準文獻方法自己商品化材料加以製備。通式(13)之肟係為習知化合物或者已商品化或者可根據為此技藝人士習知的方法加以製備。

式(I)化合物為活性殺真菌劑且可用以控制一或多種以下病原體：稻穀及小麥上之稻梨孢(*Pyricularia oryzae*) (稻瘟病菌 (*Magnaporthe grisea*) 及其他宿主上之其他梨胞黴屬 (*Pyricularia spp.*)；小麥葉鏽菌 (*Puccinia triticina*) 或(*Puccinia recondita*)、小麥條鏽菌 (*Puccinia striiformis*) 及小麥上之其他鏽菌，大麥柄鏽菌 (*Puccinia hordei*)、小麥條鏽菌及大麥上之其他鏽菌，及其他宿主(例如草皮、裸麥、咖啡、梨、蘋果、花生、甜菜、蔬菜及觀賞植物)上之鏽菌；大豆銹病 (*Phakopsora pachyrhizi*)；葫蘆科植物(例如瓜類)上之二孢白粉菌(*Erysiphe cichoracearum*)；大麥、小麥、裸麥及草皮上之小麥白粉病菌 (*Biumeria graminis* 或 *Erysiphe graminis*) (白粉病)，及各種宿主上之其他白粉病，諸如啤酒花上之草莓白粉病菌 (*Sphaerotheca macularis*)，葫蘆科植物(例如黃瓜)上之黃瓜白粉病菌 (*Sphaerotheca fusca*) (*Sphaerotheca fuliginea*)，番茄、茄子及青椒上之辣椒白粉病菌 (*Leveillula*

taurica)，蘋果上之白叉絲單囊殼菌 (*Podosphaera leucotricha*) 及葡萄樹上之葡萄鉤絲殼 (*Uncinula necator*)；禾穀 (小麥、大麥、裸麥)、草皮及其他宿主上之孢腔菌屬 (*Cochliobolus spp.*)、長蠕孢菌屬 (*Heiminthosporium spp.*)、德氏黴菌屬 (*Drechslera spp.*)、核腔菌屬 (*Pyrenophora spp.*)、喙孢屬 (*Rhynchosporium spp.*)、禾生球腔菌 (*Mycosphaerella graminicola*) (小麥殼針孢 (*Septoria tritici*)) 及子囊真菌 (*Phaeosphaeria nodorum*) (穎枯殼針孢 (*Stagonospora nodorum* 或 *Septoria nodorum*))、小麥基腐病菌 (*Pseudocercospora herpotrichoides*) 及禾頂囊殼 (*Gaeumannomyces graminis*)；花生上之花生黑斑病菌 (*Cercospora arachidicola*) 及落花生短胖孢 (*Cercosporidium personatum*) 及例如甜菜、香蕉、大豆及稻穀之其他宿主上之其他尾孢屬 (*Cercospora spp.*)；番茄、草莓、蔬菜、葡萄樹及其他宿主上之灰黴病菌 (*Botrytis cinerea*) (灰黴病) 及其他宿主上之其他灰黴病菌 (*Botrytis spp.*)；蔬菜 (例如胡蘿蔔)、油菜、蘋果、番茄、馬鈴薯、禾穀 (例如小麥) 及其他宿主上之鏈格菌 (*Alternaria spp.*)；蘋果、梨、核果、木本堅果及其他宿主上之黑星病菌 (*Venturia spp.*)，(包括蘋果黑星菌 (*Venturia inaequalis*) (瘡痂病))；包括禾穀 (例如小麥) 及番茄之一系列宿主上的芽枝黴屬 (*Cladosporium spp.*)；核果、木本堅果及其他宿主上之褐腐病菌 (*Monilinia spp.*)；番茄、草皮、小麥、葫蘆科植物及其他宿主上之疫

病菌 (*Didymella spp.*) ; 油菜、草皮、稻穀、馬鈴薯、小麥及其他宿主上之莖點黴屬 (*Phoma spp.*) ; 小麥、原木及其他宿主上之麴黴屬 (*Aspergillus spp.*) 及短梗黴屬 (*Aureobasidium spp.*) ; 豌豆、小麥、大麥及其他宿主上之殼二孢 (*Ascochyta spp.*) ; 蘋果、梨、洋蔥及其他宿主上之匍枝黴 (*Stemphylium spp.*) (格孢腔菌屬 (*Pleospora spp.*)) ; 蘋果及梨上之夏季疾病 (例如苦腐病 (葡萄晚腐病菌 (*Glomerella cingulata*))、黑腐病 (*black rot*) 或蛙眼病 (*frogeye leaf spot*) (葡萄座腔菌屬 (*Botryosphaeria obtusa*))、黑點病 (*Brooks fruit spot*) (黑點病菌 (*Mycosphaerella pomi*))、檜膠銹病 (*Cedar apple rust*) (檜膠鏽菌 (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*))、煤汙病 (*sooty blotch*) (仁果黏殼孢 (*Gloeodes pomigena*))、小斑 (*flyspeck*) *Schizothyrium pomi* 及白腐 (*white rot*) (子囊菌 (*Botryosphaeria dothidea*)) ; 葡萄樹上之葡萄霜黴病 (*Plasmopara viticola*) ; 向日葵上的霜霉病菌 (*Plasmopara halstedii*) ; 其他霜黴病 (*downy mildews*) , 諸如萵苣上之萵苣盤梗黴 (*Bremia lactucae*) , 大豆、煙草、洋蔥及其他宿主上之霜黴菌 (*Peronospora spp.*) , 啤酒花上之假霜黴 (*Pseudoperonospora humuli*) , 玉米、高粱和其他宿主上之玉米霜黴病菌 (*Peronosclerospora maydis* , *P. philippinensis* 和銹病菌 (*P. sorghi*) , 及葫蘆上之南瓜假霜黴 (*Pseudoperonospora cubensis*) ; 棉花、玉米、大豆、甜菜、草皮及其他宿主上之腐黴菌 (*Pythium spp.*) (包括

終極腐黴 (*Pythium ultimum*) ; 馬鈴薯及番茄上之晚疫病菌 (*Phytophthora infestans*) 及蔬菜、草莓、鱈梨、胡椒、觀賞植物、煙草、可可粉及其他宿主上之其他疫黴菌 (*Phytophthora spp.*) ; 小麥、棉花、玉米、大豆、甜菜、稻穀及草皮及其他宿主上之水稻紋枯病菌 (*Thanatephorus cucumeris*) 及諸如小麥及大麥、花生、蔬菜、棉花及草皮之各種宿主上之其他絲核菌 (*Rhizoctonia spp.*) ; 草皮、花生、馬鈴薯、油菜及其他宿主上之核盤菌屬 (*Sclerotinia spp.*) ; 草皮、花生、及其他宿主上之菌核菌 (*Sclerotium spp.*) ; 稻穀上之藤倉赤黴 (*Gibberella fujikuroi*) ; 包括草皮、咖啡及蔬菜之一系列宿主上之炭疽病菌 (*Colletotrichum spp.*) ; 草皮上之紅絲病菌 (*Laetisaria fuciformis*) ; 香蕉、花生、柑桔、美洲山核桃、番木瓜及其他宿主上之球腔菌 (*Mycosphaerella spp.*) ; 柑桔、大豆、瓜類、梨、羽扇豆及其他宿主上之豆莢腐爛病菌 (*Diaporthe spp.*) ; 柑桔、葡萄樹、橄欖、美洲山核桃、玫瑰及其他宿主上之痂囊腔菌屬 (*Elsinoe spp.*) ; 包括啤酒花、馬鈴薯及番茄之一系列宿主上之輪枝孢菌 (*Verticillium spp.*) ; 油菜及其他宿主上之黃斑病菌 (*Pyrenopeziza spp.*) ; 可可粉上引起導管梢枯 (vascular streak dieback) 之可可瘤腫擔子菌 (*Oncobasidium theobromae*) ; 在小麥、大麥、稈麥、燕麥、及玉蜀黍、棉花、大豆、甜菜和其他宿主之上的鐮孢菌屬 (*Fusarium spp.*) (其包括鐮刀菌根腐病菌 (*Fusarium culmorum*)、禾穀鐮刀菌 (*Fusarium graminearum*)、梨抱鐮刀

菌 (*F. langsethiae*)、串珠镰刀菌 (*Fusarium moniliforme*)、尖镰孢霉 (*Fusarium oxysporum*)、镰胞病菌 (*Fusarium proliferatum*)、胶孢镰刀菌 (*Fusarium subglutinans*)、腐皮镰孢菌 (*Fusarium solani*) 和萎凋病菌 (*F. oxysporum*)、雪腐病菌 (*Typhula spp.*)、雪霉镰孢菌 (*Microdochium nivale*)、黑粉菌属 (*Ustilago spp.*)、黑粉病菌 (*Urocystis spp.*)、腥黑穗病菌 (*Tilletia spp.*) 及麦角菌 (*Claviceps purpurea*)；甜菜、大麦及其他宿主上之锈腐柱隔孢 (*Ramularia spp.*)；尤其果实之收穫後疾病 (例如橙上之指状笔霉 (*Penicillium digitatum*)、绿青霉 (*Penicillium italicum*) 及绿木霉 (*Trichoderma viride*)，香蕉上之炭疽病菌 (*Colletotrichum musae*) 及 (*Gloeosporium musarum*) 及葡萄上之灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*)；葡萄树上之其他病原體，尤其葡萄枝枯病菌 (*Eutypa lata*)、葡萄球座菌 (*Guignardia bidwellii*)、葡萄拟茎点霉 (*Phellinus igniarius*)、葡萄蔓割病 (*Phomopsis viticola*)、葡萄角斑葉焦病菌 (*Pseudopeziza tracheiphila*) 及韧革菌 (*Stereum hirsutum*)；樹 (例如松針葉病菌 (*Lophodermium seditiosum*)) 或原木上之其他病原體，尤其 *Cephaloascus fragrans*、长喙壳菌 (*Ceratocystis spp.*)、线嘴壳菌 (*Ophiostoma piceae*)、青霉属 (*Penicillium spp.*)、拟康氏木霉 (*Trichoderma pseudokoningii*)、绿木霉 (*Trichoderma viride*)、木霉菌 (*Trichoderma harzianum*)、黑麴霉 (*Aspergillus niger*)、*Leptographium lindbergi* 及出芽短梗霉 (*Aureobasidium pullulans*)；及病毒疾病之真菌

載體（例如禾穀上之禾穀多黏菌（*Polymyxa graminis*）作為大麥黃花葉病毒屬（*barley yellow mosaic virus*，BYMV）之載體且甜菜上之甜菜多黏菌（*Polymyxa betae*）作為叢根病（*rhizomania*）之載體）。

較佳者，可以控制以下病原體：稻穀及小麥上之稻梨孢（*Pyricularia oryzae*）（稻瘟病菌（*Magnaporthe grisea*）及其他宿主上之其他梨胞黴屬（*Pyricularia* spp.）；

葫蘆科植物（例如瓜類）上之二孢白粉菌（*Erysiphe cichoracearum*）；大麥、小麥、裸麥及草皮上之小麥白粉病菌（*Biumeria graminis* 或 *Erysiphe graminis*）（白粉病），及各種宿主上之其他白粉病，諸如啤酒花上之草莓白粉病菌（*Sphaerotheca macularis*），葫蘆科植物（例如黃瓜）上之黃瓜白粉病菌（*Sphaerotheca fusca*）（*Sphaerotheca fuliginea*），番茄、茄子及青椒上之辣椒白粉病菌（*Leveillula taurica*），蘋果上之白叉絲單囊殼菌（*Podosphaera leucotricha*）及葡萄樹上之葡萄鉤絲殼（*Uncinula necator*）；禾穀（小麥、大麥、裸麥）、草皮及其他宿主上之長蠕孢菌屬（*Heiminthosporium* spp.）、德氏黴菌屬（*Drechslera* spp.）、核腔菌屬（*Pyrenophora* spp.）、喙孢屬（*Rhynchosporium* spp.）、禾生球腔菌（*Mycosphaerella graminicola*）（小麥殼針孢（*Septoria tritici*））及子囊真菌（*Phaeosphaeria nodorum*）（穎枯殼針孢（*Stagonospora nodorum* 或 *Septoria nodorum*））、小麥基腐病菌（*Pseudocercospora herpotrichoides*）及禾頂囊殼

(*Gaeumannomyces graminis*) ; 花生上之花生黑斑病菌 (*Cercospora arachidicola*) 及落花生短胖孢 (*Cercosporidium personatum*) 及例如甜菜、香蕉、大豆及稻穀之其他宿主上之其他尾孢屬 (*Cercospora spp.*) ; 番茄、草莓、蔬菜、葡萄樹及其他宿主上之灰黴病菌 (*Botrytis cinerea*) (灰黴病) 及其他宿主上之其他灰黴病菌 (*Botrytis spp.*) ; 蔬菜 (例如胡蘿蔔)、油菜、蘋果、番茄、馬鈴薯、禾穀 (例如小麥) 及其他宿主上之鏈格菌 (*Alternaria spp.*) ; 蘋果、梨、核果、木本堅果及其他宿主上之黑星病菌 (*Venturia spp.*) , (包括蘋果黑星菌 (*Venturia inaequalis*) (瘡痂病)) ; 包括禾穀 (例如小麥) 及番茄之一系列宿主上的芽枝黴屬 (*Cladosporium spp.*) ; 核果、木本堅果及其他宿主上之褐腐病菌 (*Monilinia spp.*) ; 番茄、草皮、小麥、葫蘆科植物及其他宿主上之疫病菌 (*Didymella spp.*) ; 油菜、草皮、稻穀、馬鈴薯、小麥及其他宿主上之莖點黴屬 (*Phoma spp.*) ; 小麥、原木及其他宿主上之麴黴屬 (*Aspergillus spp.*) 及短梗黴屬 (*Aureobasidium spp.*) ; 豌豆、小麥、大麥及其他宿主上之殼二孢 (*Ascochyta spp.*) ; 蘋果、梨、洋蔥及其他宿主上之匍枝黴 (*Stemphylium spp.*) (格孢腔菌屬 (*Pleospora spp.*)) ; 蘋果及梨上之夏季疾病 (例如苦腐病 (葡萄晚腐病菌 (*Glomerella cingulata*))) 、黑腐病 (*black rot*) 或蛙眼病 (*frogeye leaf spot*) (葡萄座腔菌屬 (*Botryosphaeria obtusa*)) 、黑點病 (*Brooks fruit spot*) (黑點病菌 (*Mycosphaerella pomi*)) 、檜膠銹病 (*Cedar*

apple rust) (檜膠鏽菌 (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*))、煤汙病 (sooty blotch) (仁果黏殼孢 (*Gloeodes pomigena*))、小斑 (flyspeck) *Schizothyrium pomi* 及白腐 (white rot) (子囊菌 (*Botryosphaeria dothidea*))；葡萄樹上之葡萄霜黴病 (*Plasmopara viticola*)；向日葵上的霜霉病菌 (*Plasmopara halstedii*)；其他霜黴病 (downy mildews)，諸如萵苣上之萵苣盤梗黴 (*Bremia lactucae*)，大豆、煙草、洋蔥及其他宿主上之霜黴菌 (*Peronospora* spp.)，啤酒花上之假霜黴 (*Pseudoperonospora humuli*)，玉米、高粱和其他宿主上之玉米霜黴病菌 (*Peronosclerospora maydis*, *P. philippinensis* 和銹病菌 (*P. sorghi*)，及葫蘆上之南瓜假霜黴 (*Pseudoperonospora cubensis*)；棉花、玉米、大豆、甜菜、草皮及其他宿主上之腐黴菌 (*Pythium* spp.) (包括終極腐黴 (*Pythium ultimum*))；馬鈴薯及番茄上之晚疫病菌 (*Phytophthora infestans*) 及蔬菜、草莓、鱈梨、胡椒、觀賞植物、煙草、可可粉及其他宿主上之其他疫黴菌 (*Phytophthora* spp.)；小麥、棉花、玉米、大豆、甜菜、稻穀及草皮及其他宿主上之水稻紋枯病菌 (*Thanatephorus cucumeris*) 及諸如小麥及大麥、花生、蔬菜、棉花及草皮之各種宿主上之其他絲核菌 (*Rhizoctonia* spp.)；草皮、花生、馬鈴薯、油菜及其他宿主上之核盤菌屬 (*Sclerotinia* spp.)；草皮、花生、及其他宿主上之菌核菌 (*Sclerotium* spp.)；稻穀上之藤倉赤黴 (*Gibberella fujikuroi*)；包括草皮、咖啡及蔬菜之一系

列宿主上之炭疽病菌 (*Colletotrichum spp.*) ; 草皮上之紅絲病菌 (*Laetisaria fuciformis*) ; 香蕉、花生、柑桔、美洲山核桃、番木瓜及其他宿主上之球腔菌 (*Mycosphaerella spp.*) ; 在小麥、大麥、稈麥、燕麥、及玉蜀黍、棉花、大豆、甜菜和其他宿主之上的鐮孢菌屬 (*Fusarium spp.*) (其包括鐮刀菌根腐病菌 (*Fusarium culmorum*)、禾穀鐮刀菌 (*Fusarium graminearum*)、梨抱鐮刀菌 (*F. langsethiae*)、串珠鐮刀菌 (*Fusarium moniliforme*)、尖鐮孢黴 (*Fusarium oxysporum*)、鐮胞病菌 (*Fusarium proliferatum*)、膠孢鐮刀菌 (*Fusarium subglutinans*)、腐皮鐮孢菌 (*Fusarium solani*) 和萎凋病菌 (*F. oxysporum*)、雪黴鐮孢菌 (*Microdochium nivale*)、黑粉菌屬 (*Ustilago spp.*)、黑粉病菌 (*Urocystis spp.*)、腥黑穗病菌 (*Tilletia spp.*) 及麥角菌 (*Claviceps purpurea*) ; 甜菜、大麥及其他宿主上之鏽腐柱隔孢 (*Ramularia spp.*) ; 尤其果實之收穫後疾病 (例如橙上之指狀筆黴 (*Penicillium digitatum*)、綠青黴 (*Penicillium italicum*) 及綠木黴 (*Trichoderma viride*) , 香蕉上之炭疽病菌 ((*Colletotrichum musae*) 及 (*Gloeosporium musarum*)) 及葡萄上之灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*) ; 葡萄樹上之其他病原體, 尤其葡萄枝枯病菌 (*Eutypa lata*)、葡萄球座菌 (*Guignardia bidwellii*)、葡萄擬莖點黴 (*Phellinus igniarius*)、葡萄蔓割病 (*Phomopsis viticola*)、葡萄角斑葉焦病菌 (*Pseudopeziza tracheiphila*) 及韌革菌 (*Stereum hirsutum*) ; 樹 (例如松針葉病菌 (*Lophodermium seditiosum*))

或原木上之其他病原體，尤其 *Cephaloascus fragrans*、長喙殼菌 (*Ceratocystis spp.*)、線嘴殼菌 (*Ophiostoma piceae*)、青黴屬 (*Penicillium spp.*)、擬康氏木黴 (*Trichoderma pseudokoningii*)、綠木黴 (*Trichoderma viride*)、木黴菌 (*Trichoderma harzianum*)、黑麴黴 (*Aspergillus niger*)、*Leptographium lindbergi* 及出芽短梗黴 (*Aureobasidium pullulans*)。

最佳者，可以控制以下病原體：稻穀及小麥上之稻梨孢 (*Pyricularia oryzae*) (稻瘟病菌 (*Magnaporthe grisea*) 及其他宿主上之其他梨孢黴屬 (*Pyricularia spp.*)；葫蘆科植物 (例如瓜類) 上之二孢白粉菌 (*Erysiphe cichoracearum*)；大麥、小麥、裸麥及草皮上之小麥白粉病菌 (*Biumeria graminis* 或 *Erysiphe graminis*) (白粉病)，及各種宿主上之其他白粉病，諸如啤酒花上之草莓白粉病菌 (*Sphaerotheca macularis*)，葫蘆科植物 (例如黃瓜) 上之黃瓜白粉病菌 (*Sphaerotheca fusca*) (*Sphaerotheca fuliginea*)，番茄、茄子及青椒上之辣椒白粉病菌 (*Leveillula taurica*)，蘋果上之白叉絲單囊殼菌 (*Podosphaera leucotricha*) 及葡萄樹上之葡萄鉤絲殼 (*Uncinula necator*)；禾穀 (小麥、大麥、裸麥)、草皮及其他宿主上之)、禾生球腔菌 (*Mycosphaerella graminicola*) (小麥殼針孢 (*Septoria tritici*)) 及子囊真菌 (*Phaeosphaeria nodorum*) (穎枯殼針孢 (*Stagonospora nodorum* 或 *Septoria nodorum*))、小麥基腐病菌 (*Pseudocercospora*)

herpotrichoides) 及禾頂囊殼 (*Gaeumannomyces graminis*) ; 花生上之花生黑斑病菌 (*Cercospora arachidicola*) 及落花生短胖孢 (*Cercosporidium personatum*) 及例如甜菜、香蕉、大豆及稻穀之其他宿主上之其他尾胞屬 (*Cercospora* spp.) ; 番茄、草莓、蔬菜、葡萄樹及其他宿主上之灰黴病菌 (*Botrytis cinerea*) (灰黴病) 及其他宿主上之其他灰黴病菌 (*Botrytis* spp.) ; 蔬菜 (例如胡蘿蔔)、油菜、蘋果、番茄、馬鈴薯、禾穀 (例如小麥) 及其他宿主上之鏈格菌 (*Alternaria* spp.) ; 蘋果、梨、核果、木本堅果及其他宿主上之黑星病菌 (*Venturia* spp.) , (包括蘋果黑星菌 (*Venturia inaequalis*) (瘡痂病)) ; 包括禾穀 (例如小麥) 及番茄之一系列宿主上的芽枝黴屬 (*Cladosporium* spp.) ; 核果、木本堅果及其他宿主上之褐腐病菌 (*Monilinia* spp.) ; 番茄、草皮、小麥、葫蘆科植物及其他宿主上之疫病菌 (*Didymella* spp.) ; 油菜、草皮、稻穀、馬鈴薯、小麥及其他宿主上之莖點黴屬 (*Phoma* spp.) ; 葡萄樹上之葡萄霜黴病 (*Plasmopara viticola*) ; 向日葵上的霜霉病菌 (*Plasmopara halstedii*) ; 其他霜黴病 (*downy mildews*) , 諸如萵苣上之萵苣盤梗黴 (*Bremia lactucae*) , 大豆、煙草、洋蔥及其他宿主上之霜黴菌 (*Peronospora* spp.) , 啤酒花上之假霜黴 (*Pseudoperonospora humuli*) , 玉米、高粱和其他宿主上之玉米霜黴病菌 (*Peronosclerospora maydis* , *P. philippinensis* 和銹病菌 (*P. sorghi*) , 及葫蘆上之南瓜假霜黴 (*Pseudoperonospora cubensis*) ; 棉花、玉米、大豆、

甜菜、草皮及其他宿主上之腐黴菌 (*Pythium spp.*) (包括終極腐黴 (*Pythium ultimum*)) ; 馬鈴薯及番茄上之晚疫病菌 (*Phytophthora infestans*) 及蔬菜、草莓、鱈梨、胡椒、觀賞植物、煙草、可可粉及其他宿主上之其他疫黴菌 (*Phytophthora spp.*) ; 小麥、棉花、玉米、大豆、甜菜、稻穀及草皮及其他宿主上之水稻紋枯病菌 (*Thanatephorus cucumeris*) 及諸如小麥及大麥、花生、蔬菜、棉花及草皮之各種宿主上之其他絲核菌 (*Rhizoctonia spp.*) ; 草皮、花生、馬鈴薯、油菜及其他宿主上之核盤菌屬 (*Sclerotinia spp.*) ; 草皮、花生、及其他宿主上之菌核菌 (*Sclerotium spp.*) ; 稻穀上之藤倉赤黴 (*Gibberella fujikuroi*) ; 包括草皮、咖啡及蔬菜之一系列宿主上之炭疽病菌 (*Colletotrichum spp.*) ; 草皮上之紅絲病菌 (*Laetisaria fuciformis*) ; 香蕉、花生、柑桔、美洲山核桃、番木瓜及其他宿主上之球腔菌 (*Mycosphaerella spp.*) ; 在小麥、大麥、裸麥、燕麥、及玉蜀黍、棉花、大豆、甜菜和其他宿主之上的鐮孢菌屬 (*Fusarium spp.*) (其包括鐮刀菌根腐病菌 (*Fusarium culmorum*)、禾穀鐮刀菌 (*Fusarium graminearum*)、梨抱鐮刀菌 (*F. langsethiae*)、串珠鐮刀菌 (*Fusarium moniliforme*)、尖鐮孢黴 (*Fusarium oxysporum*)、鐮胞病菌 (*Fusarium proliferatum*)、膠孢鐮刀菌 (*Fusarium subglutinans*)、腐皮鐮孢菌 (*Fusarium solani*) 和萎凋病菌 (*F. oxysporum*)、雪黴鐮孢菌 (*Microdochium nivale*) 。

式 (I) 化合物可在植物組織中向頂、向基或局部移動

以具有抗一或多種真菌之活性。此外，式 (I) 化合物可具足夠大的揮發性以在蒸氣相具有抗植物上之一或多種真菌之活性。

因此本發明提供對抗或控制植物病原性真菌之方法，其包含向植物、植物之種子、植物或種子所在地或土壤或任何其他植物生長介質（例如營養液）施用殺真菌有效量之式 (I) 化合物或含有式 (I) 化合物之組合物。

如本文中所用術語「植物」包括植物苗、有用植物之農作物、灌木及樹木。此外，本發明之殺真菌方法包括保護性、治療性、系統性、剷除性及抗孢子形成處理。

式 (I) 化合物較佳以組合物形式用於農業、園藝及草坪草目的。

為將式 (I) 化合物施用至植物、植物之種子、植物或種子所在地或土壤或任何其他生長介質，通常將式 (I) 化合物調配成除式 (I) 化合物外還包括適當惰性稀釋劑或載劑及視情況表面活性劑 (SFA) 之組合物。表面活性劑為藉由降低界面張力且藉此引起其他特性（例如分散、乳化及濕潤）改變而能夠改變界面（例如液體/固體、液體/空氣或液體/液體界面）特性之化學物質。較佳所有組合物（固體及液體調配物）皆包含 0.0001 至 95 重量%、更佳 1 至 85 重量%，例如 5 至 60 重量%之式 (I) 化合物。該組合物通常用於控制真菌使得以每公頃 0.1 g 至 10 kg、較佳地每公頃 1 g 至 6 kg、更佳每公頃 1 g 至 1 kg 之比率施用式 (I) 化合物。

當用於拌種時，以每公斤種子 0.0001 g 至 10 g（例如 0.001 g 或 0.05 g）、較佳地 0.005 g 至 10 g、更佳 0.005 g 至 4 g 之比率使用式（I）化合物。

在另一態樣中，本發明提供包含殺真菌有效量之式（I）化合物及其適當載劑或稀釋劑的殺真菌組合物。

在另一態樣中，本發明提供在所在地對抗及控制真菌之方法，其包含以殺真菌有效量之包含式（I）化合物的組合物處理真菌或真菌所在地。可自許多調配物類型選擇組合物，該等類型包括撒布型粉劑（dustable powder, DP）、可溶性粉劑（soluble powder, SP）、水溶性粒劑（water soluble granule, SG）、水分散性粒劑（water dispersible granule, WG）、可濕性粉劑（wetable powder, WP）、粒劑（granule, GR）（緩慢或快速釋放）、可溶性濃縮液（soluble concentrate, SL）、油混溶液劑（oil miscible liquid, OL）、超低容量液劑（ultra low volume liquid, UL）、可乳化濃縮液（emulsifiable concentrate, EC）、分散性濃縮液（dispersible concentrate, DC）、乳劑（水包油型（oil in water, EW）與油包水型（water in oil, EO））、微乳劑（micro-emulsion, ME）、懸浮濃縮液（suspension concentrate, SC）、氣溶膠、霧劑/煙霧調配物、膠囊懸浮液（capsule suspension, CS）及種子處理調配物。在任一情況下所選擇之調配物類型將依賴於所構想之特定目的及式（I）化合物之物理、化學及生物特性。

可藉由混合式（I）化合物與一或多種固體稀釋劑（例

如天然黏土、高嶺土、葉蠟石 (pyrophyllite)、膨潤土、氧化鋁、蒙脫石、矽藻土 (kieselguhr)、白堊、矽藻土 (diatomaceous earths)、磷酸鈣、碳酸鈣及碳酸鎂、硫、石灰、麵粉、滑石及其他有機及無機固體載劑) 且以機械方式將該混合物研磨成細粉末來製備撒布型粉劑 (DP)。

可藉由混合式 (I) 化合物與一或多種水溶性無機鹽 (諸如碳酸氫鈉、碳酸鈉或硫酸鎂) 或一或多種水溶性有機固體 (諸如多醣) 及視情況一或多種濕潤劑、一或多種分散劑或該等試劑之混合物以提高水分散性/溶解性來製備可溶性粉劑 (SP)。接著將該混合物研磨成細粉末。亦可將相似組合物粒化以形成水溶性粒劑 (SG)。

可藉由混合式 (I) 化合物與一或多種固體稀釋劑或載劑、一或多種濕潤劑及較佳地一或多種分散劑及視情況一或多種懸浮劑以促進在液體中之分散來製備可濕性粉劑 (WP)。接著將該混合物研磨成細粉末。亦可將相似組合物粒化以形成水分散性粒劑 (WG)。

可藉由將式 (I) 化合物與一或多種粉狀固體稀釋劑或載劑之混合物粒化形成粒劑 (GR)，或藉由在多孔粒狀材料 (諸如浮石、矽鎂土、黏土、漂白土、矽藻土 (kieselguhr)、矽藻土 (diatomaceous earths) 或碎玉米穗軸) 中吸收式 (I) 化合物 (或其在適當試劑中之溶液) 自預先形成之空白顆粒形成粒劑 (GR)，或藉由將式 (I) 化合物 (或其在適當試劑中之溶液) 吸附於硬核材料 (諸如沙、矽酸鹽、無機碳酸鹽、硫酸鹽或磷酸鹽) 上且必要時乾燥來形成粒劑

(GR)。通常用以輔助吸收或吸附之試劑包括溶劑（諸如脂族及芳族石油溶劑、醇、醚、酮及酯）及黏著劑（諸如聚乙酸乙烯酯、聚乙烯醇、糊精、糖及植物油）。亦可將一或多種其他添加劑（例如乳化劑、濕潤劑或分散劑）包括於粒劑中。

可藉由將式（I）化合物溶解於水中或諸如酮、醇或乙二醇醚之有機溶劑中製備分散性濃縮液（DC）。該等溶液可含有表面活性劑（例如以提高水稀釋或防止在噴霧罐中結晶）。

可藉由在有機溶劑（視情況含有一或多種濕潤劑、一或多種乳化劑或該等試劑之混合物）中溶解式（I）化合物製備可乳化濃縮液（EC）或水包油乳劑（EW）。適用於EC之適當有機溶劑包括芳族烴（諸如烷基苯或烷基萘，藉由 SOLVESSO 100、SOLVESSO 150 及 SOLVESSO 200 來例示；SOLVESSO 為註冊商標）、酮類（諸如環己酮或甲基環己酮）、醇類（諸如苶醇、糠醇或丁醇）、N-烷基吡咯啉酮（諸如 N-甲基吡咯啉酮或 N-辛基吡咯啉酮）、脂肪酸之二甲基鹽胺（諸如 C₈-C₁₀ 脂肪酸二甲基鹽胺）及氯化烴類。添加至水後 EC 產物可自發地乳化以產生具有足夠穩定性以便能經由適當設備噴霧施用之乳液。EW 之製備包括獲得以液體形式（若在環境溫度下不為液體，則其可在通常低於 70°C 之合理溫度下熔融）或在溶液中（藉由將其溶解於適當溶劑中）之式（I）化合物，且隨後在高剪切下使所得液體或溶液乳化於含有一或多種表面活性劑之水中以

產生乳劑。用於 EW 之適當溶劑包括植物油、氯化烴類（諸如氯苯）、芳族溶劑（諸如烷基苯或烷基萘）及其他在水中具有低溶解度之適當有機溶劑。

可藉由混合水與一或多種溶劑與一或多種表面活性劑之摻合物以自發產生熱力學穩定的各向同性液體調配物來製備微乳劑（ME）。最初式（I）化合物存在於水或溶劑/表面活性劑摻合物中。用於 ME 之適當溶劑包括彼等在上文對於用於 EC 或 EW 所述者。ME 可為水包油或油包水系統（可藉由電導率量測確定該系統之存在）且可適於在同一調配物中混合水溶性及油溶性殺蟲劑。ME 適合於稀釋於水中，保持微乳劑形式或形成習知水包油乳劑。

懸浮濃縮液（SC）可包含式（I）化合物之細粉狀不溶性固體顆粒之水性或非水性懸浮液。可藉由在適當介質中視情況與一或多種分散劑一起球磨或珠磨式（I）之固體化合物以產生化合物之細粒懸浮液來製備 SC。可將一或多種濕潤劑包括於組合物中且可包括懸浮劑以降低顆粒沈澱之速率。或者，可將式（I）化合物乾式研磨且添加至含有上文所述之試劑的水以產生所需終產物。

氣溶膠調配物包含式（I）化合物及適當推進劑（例如正丁烷）。亦可將式（I）化合物溶解或分散於適當介質（例如水或水混溶液體，諸如正丙醇）中以提供用於非加壓、手動噴霧泵之組合物。

可以乾燥狀態混合式（I）化合物與煙火（pyrotechnic）混合物以形成適於在封閉空間產生含有該化合物之煙霧的

組合物。

可以類似於製備 EW 調配物之方式但以使得獲得油液滴之水性分散液的另一聚合階段製備膠囊懸浮液 (CS)，其中各油液滴由聚合物殼囊封且含有式 (I) 化合物及視情況其載劑或稀釋劑。可藉由界面縮聚反應或藉由凝聚程序產生聚合物殼。該等組合物可提供式 (I) 化合物之控釋且其可用於種子處理。亦可將式 (I) 化合物調配於生物可降解聚合物基質中以提供化合物之緩慢控釋。

組合物可包括一或多種添加劑以提高組合物之生物效能（例如提高表面上之濕潤、存留或分布；對所處理表面上之雨水的抗性；或式 (I) 化合物之吸收或遷移力）。該等添加劑包括表面活性劑、基於例如某些礦物油或天然植物油（諸如大豆及菜籽油）之油之噴霧添加劑，及該等物質與其他生物強化佐劑（可輔助或改變式 (I) 化合物之作用的成份）之摻合物。

式 (I) 化合物亦可經調配以用作種子處理，例如以粉末組合物形式，包括用於乾種子處理之粉劑 (DS)、用於漿液處理之水溶性粉劑 (SS) 或水分散性粉劑 (WS)，或以液體組合物形式，包括可流動濃縮液 (FS)、溶液 (LS) 或膠囊懸浮液 (CS)。DS、SS、WS、FS 及 LS 組合物之製備分別極類似於上文所述 DP、SP、WP、SC 及 DC 組合物之製備。用於處理種子之組合物可包括用於輔助組合物與種子之黏附的試劑（例如礦物油或成膜阻隔劑 (film-forming barrier)）。濕潤劑、分散劑及乳化劑可為陽離子

型、陰離子型、兩性或非離子型表面活性劑。

陽離子型之適當表面活性劑包括四級銨化合物（例如溴化十六烷基三甲銨）、咪唑啉及胺鹽。適當陰離子型表面活性劑包括脂肪酸鹼金屬鹽、硫酸之脂族單酯之鹽（例如月桂基硫酸鈉）、磺化芳族化合物之鹽（例如十二烷基苯磺酸鈉、十二烷基苯磺酸鈣、丁基萘磺酸鹽及二-異丙基萘磺酸鈉與三-異丙基萘磺酸鈉之混合物）、醚硫酸鹽、醇醚硫酸鹽（例如月桂基醚-3-硫酸鈉）、醚羧酸鹽（例如月桂基醚-3-甲酸鈉）、磷酸酯（一或多種脂肪醇與磷酸（主要單酯）或五氧化二磷（主要雙酯）反應之產物，例如月桂醇與四磷酸之間的反應；另外該等產物可經乙氧基化）、磺基琥珀醯胺酸鹽（sulphosuccinamate）、烷烴或烯烴磺酸鹽、牛磺酸鹽及木質素磺酸鹽。兩性類型之適當表面活性劑包括甜菜鹼、丙酸鹽及甘胺酸鹽。

非離子型適當表面活性劑包括諸如氧化乙烯、氧化丙烯、氧化丁烯或其混合物之氧化烯與脂肪醇（諸如油醇或十六烷醇）或烷基酚（諸如辛基酚、壬基酚或辛基甲酚）之縮合產物；衍生自長鏈脂肪酸或己糖醇酐之偏酯；該等偏酯與氧化乙烯之縮合產物；嵌段聚合物（包含氧化乙烯及氧化丙烯）；烷醇醯胺；簡單酯類（例如脂肪酸聚乙二醇酯）；氧化胺（例如月桂基二甲基氧化胺）；及卵磷脂。

適當懸浮劑包括親水膠體（諸如多醣、聚乙烯吡咯啉酮或羧甲基纖維素鈉）及膨脹黏土（諸如膨潤土或矽鎂土）。

可藉由施用殺真菌性化合物之任一已知方式施用式(I)

化合物。例如，其可以調配形式或非調配形式直接施用至植物之包括葉、莖、枝或根在內的任何部分；種植之前的種子；或植物生長或待種植之其他介質（諸如根周圍之土壤、土壤通常稻田水或溶液培養系統）；或其可噴霧、撒布、藉由浸漬施用、以乳膏或糊劑調配物形式施用、以蒸氣形式施用或經由在土壤或水性環境中分配或引入組合物（諸如顆粒狀組合物或包裹於水溶性袋中之組合物）施用。

亦可將式（I）之化合物注入植物或使用電動噴霧技術或其他低容量方法噴霧於植被上，或藉由土地或空中灌溉系統施用。

通常以含有高比例之活性成份之濃縮液形式提供用作水性製劑（水溶液或分散液）之組合物，在使用前將濃縮液添加至水。通常要求該等可包括 DC、SC、EC、EW、ME、SG、SP、WP、WG 及 CS 之濃縮液能夠經受住長時間儲存，且在該儲存後能夠添加至水以形成水性製劑，其在足夠長的時間內保持均勻以使其能夠藉由習知噴霧設備施用。依賴於預期使用目的，該等水性製劑可含有不同量之式（I）化合物（例如 0.0001 至 10 重量%）。

式（I）之化合物可與肥料（例如含氮、鉀或磷之肥料）混合使用。適當調配物類型包括肥料粒劑。該等混合物適當地含有多至 25 重量%-之式（I）化合物。

因此，本發明亦提供包含肥料及式（I）化合物之肥料組合物。

本發明之組合物可含有其他具有生物活性之化合物，

例如微量營養素或具有相似或互補殺真菌活性或具有植物生長調節、除草、殺昆蟲、殺線蟲或殺蟎活性之化合物。

藉由包括另一殺真菌劑，所得組合物可具有廣譜活性或比單獨式 (I) 化合物更高程度之固有活性。另外，另一殺真菌劑可對式 (I) 化合物之殺真菌活性具有增效效應。

式 (I) 之化合物可為組合物之唯一活性成份或 (若適當) 其可與一或多種諸如殺蟲劑、殺真菌劑、增效劑、除草劑或植物生長調節劑之其他活性成份混合。另一活性成份可：提供具有廣譜活性或增加之所在地持久性的組合物；使式 (I) 化合物之活性增效或補充活性 (例如藉由增加作用速度或克服抵抗性)；或有助於克服或防止對個別組份之抗性發展。特定另一活性成份將依賴於組合物之預期效用。

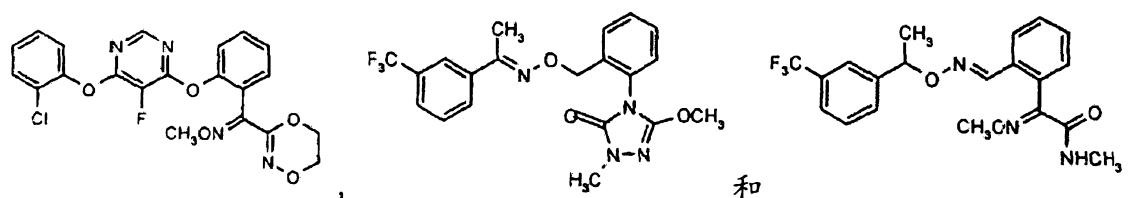
可包括於本發明組合物之殺真菌化合物的實例為 AC 382042 (N-(1-氰基-1,2-二甲基丙基)-2-(2,4-二氯苯氧基)丙醯胺)、酸化苯并噻二唑-S-甲酯 (acibenzolar-S-Methyl)、阿蘭克 (alanycarb)、阿迪嗎啉 (aldimorph)、敵菌靈 (anilazine)、阿紫康唑 (azaconazole)、唑啞草酮 (azafenidin)、亞托敏 (azoxystrobin)、本達樂 (benalaxyl)、苯菌靈 (benomyl)、苯噻菌胺 (benthiavalicarb)、雙苯三唑醇 (biloxyzol)、比多農 (bitertanol)、滅瘟素 S (blasticidin S)、波斯卡利 (boscalid) (尼可必芬 (nicobifen) 之新名稱)、溴克座 (bromuconazole)、布瑞莫 (bupirimate)、四氯丹 (captafol)、蓋普丹 (captan)、貝芬替 (carbendazim)、

貝芬替鹽酸鹽、萎鏽靈(carboxin)、加普胺(carpropamid)、
 香芹酮(carvone)、CGA 41396、CGA 41397、甲基克殺蟎
 (chinomethionate)、氯苯并噻酮(chlorbenzthiazone)、
 四氯異苯腈(chlorothalonil)、克氯得(chlorozolate)、
 科羅拉康(clozylacon)、含銅化合物(諸如氯氧化銅、氯
 基喹啉銅、硫酸銅、妥爾油酸銅(copper tallate)及波爾多
 液(Bordeaux mixture)、氰唑磺菌胺(cyamidazosulfamid)、
 賽座滅(cyazofamid)(IKF-916)、環氟菌胺
 (cyflufenamid)、霜脲氰(cymoxanil)、環克座
 (cyproconazole)、賽普洛(cyprodinil)、咪菌威(debacarb)、
 二-2-吡啶基二硫化物 1,1'-二氧化物、益發靈
 (dichlofluanid)、二氯西莫(diclocymet)、噻菌清
 (diclomezine)、氯硝胺(dicloran)、乙徽威
 (diethofencarb)、地芬康唑(difenoconazole)、雙苯唑
 快(difenzoquat)、氟嘧菌胺(diflumerim)、硫代磷酸
 O,O-二-異丙基-S-苄酯、二甲氟唑(dimefluazole)、
 二甲康唑(dimetconazole)、二甲嘧酚(dimethirimol)、
 二甲馬夫(dimethomorph)、地莫菌胺(dimoxystrobin)、
 達克利(diniconazole)、敵蟎普(dinocap)、腈硫醌
 (dithianon)、氯化十二烷基二甲基銨、嗎菌靈
 (dodemorph)、多寧(dodine)、多果定(dogvadine)、
 護粒松(edifenphos)、環氧康唑(epoxiconazole)、乙噻
 博胺(ethaboxam)、乙菌啞(ethirimol)、(Z)-N-苄基
 -N([甲基(甲基-硫代亞乙基胺基氧基羰基)胺基]硫代)-β

一 丙 胺 酸 乙 酯 、 依 得 利 (etridiazole) 、 噁 唑 菌 酮
 (famoxadone) 、 咪 唑 菌 酮 (fenamidone) 、 芬 瑞 莫
 (fenarimol) 、 芬 布 康 唑 (fenbuconazole) 、 甲 呋 噁 胺
 (fenfuram) 、 環 噁 菌 胺 (fenhexamid) 、 禾 草 靈 (fenoxanil)
 (AC 382042) 、 拌 種 咯 (fenciclonil) 、 芬 普 比 定
 (fenpropidin) 、 粉 鏽 啉 (fenpropimorph) 、 三 苯 醋 錫 (fentin
 acetate) 、 三 苯 氫 氧 化 錫 (fentin hydroxide) 、 福 美 鐵
 (ferbam) 、 噻 菌 脞 (ferimzone) 、 扶 吉 胺 (fluazinam) 、
 護 汰 寧 (fludioxonil) 、 氟 美 噁 胺 (flumetover) 、 氟 嗎 啉
 (flumorph) 、 氟 噁 亞 胺 (fluoroimide) 、 氟 氧 菌 胺
 (fluoxastrobin) 、 氟 奎 康 唑 (fluquinconazole) 、 護 矽 得
 (flusilazole) 、 氟 硫 滅 (flusulfamide) 、 福 多 寧 (flutolanil) 、
 護 汰 芬 (flutriafol) 、 福 爾 培 (folpet) 、 乙 膦 鋁 (fosetyl
 - aluminium) 、 麥 穗 靈 (fuberidazole) 、 呋 霜 靈 (furalaxyl) 、
 福 拉 比 (furametpyr) 、 克 熱 淨 (guazatine) 、 六 康 唑
 (hexaconazole) 、 羥 基 異 噁 唑 、 惡 黴 靈 (hymexazole) 、
 依 滅 列 (imazalil) 、 易 胺 座 (imibenconazole) 、 雙 胍 辛 胺
 (iminoctadine) 、 三 乙 酸 雙 胍 辛 胺 、 依 普 克 唑 (ipconazole) 、
 丙 基 喜 樂 松 (iprobenfos) 、 依 普 同 (iprodione) 、 顯 黴 威
 (iprovalicarb) 、 胺 基 甲 酸 異 丙 基 丁 酯 、 稻 瘟 靈
 (isoprothiolane) 、 春 日 黴 素 (kasugamycin) 、 甲 基 克 收
 欣 (kresoxim - methyl) 、 LY 186054 、 LY 211795 、 LY
 248908 、 錳 粉 克 (mancozeb) 、 錳 乃 浦 (maneb) 、 甲 霜 靈
 (mefenoxam) 、 噻 菌 胺 (mepaniprym) 、 滅 普 寧 (mepronil) 、

滅達樂 (metalaxyl)、滅達樂 M (metalaxyl M)、麥康唑
 (metconazole)、免得爛 (metiram)、免得爛鋅、苯氧菌
 胺 (metominostrobin)、美曲芬諾 (metrafenone)、MON65500
 (N-烯丙基-4,5-二甲基-2-三甲基矽烷基噻吩-3-
 甲醯胺)、滅克落 (myclobutanil)、NTN0301、新阿蘇仁
 (neoasozin)、二甲基二硫代胺基甲酸鎳、酞菌酯 (nitrothale
 -isopropyl)、尼瑞莫 (nuarimol)、呋喃胺 (ofurace)、
 有機汞化合物、奧瑞菌胺 (orysastrobin)、毆殺斯
 (oxadixyl)、環氧嘧磺隆 (oxasulfuron)、奧索利酸 (oxolinic
 acid)、噁咪唑 (oxpoconazole)、氧化萎鏽靈 (oxycarboxin)、
 稻瘟酯 (pefurazoate)、潘康唑 (penconazole)、賓克隆
 (pencycuron)、奮乃靜氧化物 (phenazin oxide)、磷酸、
 苯酞、啉氧菌胺 (picoxystrobin)、多氧菌素 D (polyoxin D)、
 代森聯 (polyram)、噻菌靈 (probenazole)、撲克拉
 (prochloraz)、撲滅寧 (procymidone)、普拔克
 (propamocarb)、普拔克鹽酸鹽、普克利 (propiconazole)、
 甲基鋅乃浦 (propineb)、丙酸、普奎那茲 (proquinazid)、
 普硫康唑 (prothioconazole)、百克敏 (pyraclostrobin)、
 白粉松 (pyrazophos)、比芬諾 (pyrifenox)、派美尼
 (pyrimethanil)、百快隆 (pyroquilon)、氯吡根呋醚
 (pyroxyfur)、吡咯尼群 (pyrrolnitrin)、四級銨化合物、
 滅蟊猛 (quinomethionate)、快諾芬 (quinoxifen)、奎脫
 辛 (quintozene)、矽硫芬 (silthiofam) (MON 65500)、
 S-依滅列 (S-imazalil)、矽氟唑 (simeconazole)、西

普克唑 (sipconazole)、五氯苯酚鈉、螺惡胺 (spiroxamine)、鏈黴素 (streptomycin)、硫、得克利 (tebuconazole)、克枯爛 (tecloftalam)、四氯硝基苯 (tecnazene)、氟醚唑 (tetraconazole)、噻苯達唑 (thiabendazole)、賽氟滅 (thi fluzamide)、2-(硫代氰基-甲硫基)苯并噻唑、甲基多保淨 (thiophanate-methyl)、福美雙 (thiram)、汰敵寧 (tiadinil)、替米苯康唑 (timibenconazole)、脫克松 (tolclofos-methyl)、甲基益發靈 (tolyfluanid)、三泰芬 (triadimefon)、三泰隆 (triadimenol)、丁三唑 (triazbutil)、唑菌嗪 (triazoxide)、三賽唑 (tricyclazole)、三得芬 (tridemorph)、三氟敏 (trifloxystrobin)、賽福座 (triflumizole)、賽福寧 (triforine)、環菌唑 (triticonazole)、維利黴素 A (validamycin A)、斯美地 (vapam)、免克寧 (vinclozolin)、XRD-563、鋅乃浦 (zineb)、益穗 (ziram)、氯苯醯胺 (zoxamide) 及下式之化合物：



可將式 (I) 化合物與土壤、泥炭或其他生根介質混合以保護植物抵禦種子攜帶、土壤攜帶或葉面真菌疾病。某些混合物可能包含多種活性成份，其具有顯著不同的物理、化學或生物特性，使得其不易於適合於相同習知調配物類型。在此等情況下，可製備其他調配物類型。例如，

若一種活性成份為非水溶性固體，而另一種為非水溶性液體，則可能藉由以懸浮液形式分散固體活性成份（使用類似於懸浮濃縮液（SC）之製備法的製備法），而以乳液形式分散液體活性成份（使用類似於乳劑（EW）之製備法的製備法），將各活性成份分散於同一連續水相中。所得組合物為懸浮乳劑（suspoemulsion，SE）調配物。

【實施方式】

藉由使用以下縮寫之以下實施例說明本發明：

ml = 毫升

DMF = 二甲基甲醯胺

g = 公克

NMR = 核磁共振

ppm = 每百萬之份數

HPLC = 高效液相層析

M⁺ = 質量離子

s = 單峰

q = 四重峰

d = 二重峰

m = 多重峰

br s = 寬單峰

ppm = 每百萬之份數

t = 三重峰

實施例 1

本實施例例示 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-丁氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺之製備。

第 1 階段：根據流程 3 反應式 1 製備(3-溴-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸

步驟 1：製備(3-溴-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸甲酯

將 3-溴-喹啉-6-酚 (17.47 g) (Liebigs Ann Chem 1966, 98-106 中描述其製備) 溶解於無水二甲基甲醯胺 (150 ml) 中。在室溫下將氯-甲基硫基-乙酸甲酯 (18.07 g) 及無水碳酸鉀 (43.12 g) 添加至混合物中。將所得懸浮液攪拌 2 小時，之後，反應混合物經乙酸乙酯稀釋，倒入飽和碳酸氫鈉 (200 毫升)。分離此二相，以乙酸乙酯萃取水層三次 (3x200 毫升)。混合的有機層經硫酸鎂乾燥，過濾和蒸發。殘留物經管柱層析術 (庚烷/乙酸乙酯為 7:3) 純化，製得淺黃色固體之 (3-溴-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸甲酯 (24 克)。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.81 (1H,d); 8.23 (1H,d); 8.02 (1H,d); 7.50 (1H,dd); 7.14 (1H,d); 5.72 (1H,s); 3.88 (3H,s); 2.24 (3H,s)。

步驟 2: 製備 (3-溴-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸

在室溫下將 2M 氫氧化鈉溶液 (35.06 毫升) 加入來自以上第一階段步驟 1 之 (3-溴-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸甲酯 (20 克) 在乙醇 (150 毫升) 中之溶液。在室溫之下攪拌反應混合物 2 小時。將反應混合物倒入冰冷水 (200 毫升) 中，以 2M 氫氯酸在水中之溶液 (35.06 毫升)。濾除沉澱物，以水沖洗，得到淺黃色固體之 (3-溴-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸 (18.79 克)。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 13.50 (1H,s br); 8.83 (1H,d); 8.59 (1H,d); 7.99 (1H,d); 7.57 (1H,dd); 7.50 (1H,d); 6.09

(1H,s); 2.17 (3H,s)。

第 2 階段：製備流程 7 之 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-丁氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

步驟 1：製備 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-羥基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

上述實施例 1 第一階段的(3-溴-喹啉-6-基氧基)-1-甲基硫基-乙酸(23 克)，2-胺基-2-甲基-1-丙醇(8.06 毫升)，1-羥基-7-氮雜苯並三唑(HOAT)(11.44 克)、N-(3-二甲基胺基丙基)-N'-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽(EDC)(16.12 克)及三乙胺(14.63 毫升)在無水二甲基甲醯胺中於室溫之下被 16 小時。反應混合物經乙酸乙酯稀釋，經倒入 200 毫升飽和碳酸氫鈉。分離此二相，以乙酸乙酯萃取水層三次(3x200 毫升)。混合有機層，經硫酸鎂乾燥，過濾和蒸發。殘留物經管柱層析術(庚烷/乙酸乙酯為 7:13)純化，製得白色固體之 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-羥基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(16.94 克)。

^1H NMR (DMSO) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.57 (1H,d); 7.99 (1H,d); 7.58(1H,dd); 7.52(1H,s); 7.44 (1H,d); 5.94 (1H,s); 4.99 (1H,t); 3.48—3.37(2H,m); 2.15 (3H,s); 1.28(3H,s); 1.26 (3H,s)。

步驟 2：製備 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1,1-二甲基-2-氧代-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

來自上述第 2 階段步驟 1 之 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-羥基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(0.2 克)在二氯甲烷(15 毫升)中經 Dess-Martin 高碘烷(0.42 克)處理。反應混合物在室溫之下經攪拌 1 小時。反應混合物經飽和碳酸氫鈉和飽和硫代硫酸鈉驟冷。反應混合物在室溫之下經激烈攪拌 30 分鐘，之後，分離此二相，有機層經飽和碳酸氫鈉沖洗，分離有機相之後，以硫酸鎂乾燥，過濾和蒸發。殘留物經管柱層析術(庚烷/乙酸乙酯為 1:1)純化，製得白色固體之 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1,1-二甲基-2-氧代-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(0.188 克)。¹H NMR (CDCl₃) δ ppm: 9.41 (1H,s); 8.83 (1H,d); 8.26 (1H,d); 8.08(1H,d); 7.51(1H,dd); 7.22(1H,d); 5.69 (1H,s); 2.20 (3H,s); 1.53(6H,s)。

步驟 3：製備 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-丁氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

來自上述第 2 階段步驟 2 之 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1,1-二甲基-2-氧代-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(0.1 克)，吡啶(0.022 毫升)和 O-正丁基-羥基胺鹽酸鹽(0.035 克)在甲醇(5 毫升)中，在室溫之下被攪拌 3 小時。反應混合物經乙酸乙酯稀釋，經倒入 30 毫升飽和碳酸氫鈉。分離此二相，以乙酸乙酯萃取水層三次(3x50 毫升)。混合有機層，經硫酸鎂乾燥，過濾和蒸發。殘留物經管柱層析術(庚烷/乙酸乙酯為 3:1)純化，製得 2-(3-溴-喹啉

—6—基氧基)—N—(2—丁氧基亞胺基—1,1—二甲基—乙基)—2—甲基硫基—乙醯胺(0.115 克)。 ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.81 (1H,d); 8.24 (1H,d); 8.04 (1H,d); 7.71(1H,s); 7.45(1H,dd); 7.39(1H,s); 7.17 (1H,d); 5.64 (1H,s); 4.08(2H,t); 2.19(3H,s); 1.68—1.58(8H,m); 1.45—1.36 (2H,m); 0.94 (3H,t)。

實施例 2

本實施例例示根據流程 9 製備 2—胺基—2—甲基—丙醛 O—甲基—肼

步驟 1: 2—(2—羥基—1,1—二甲基—乙基)異吲哚—1,3—二酮之製備

177.7 克的酞酸酐和 91.9 克的 2—胺基—2—甲基—丙—(1)—醇被溶於 750 毫升二甲基甲醯胺中，之後，加入觸媒數量之對—甲苯磺酸，在 145°C 攪拌此混合物 3 小時。然後，反應混合物在減壓之下濃縮，殘留物經 1N 水性鹽酸稀釋，以乙酸乙酯萃取。有機相經 1N 氫氧化鈉沖洗，經水沖洗二次。有機層經硫酸鎂乾燥，在減壓之下蒸發溶劑，得到 144.1 克的油，其供下一道步驟使用而不需要純化。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.6 (6H,s); 3.52 (1H,t); 3.93 (2H,d); 7.20—7.23(2H,m); 7.28—7.83(2H,m)。

步驟 2: 2—(1,3—二氧代—1,3—二氫—異吲哚—2—基)—2—甲基丙醛之製備

11.9 克三氧化硫吡啶錯合物經溶於 75 毫升 DMSO 後，在室溫之下於 20 分鐘加入 5.48 克來自步驟 1 之 2—(2—羥

基-1,1-二甲基-乙基)異吡啶-1,3-二酮和 7.59 克三乙胺在 780 毫升之 DMSO 中。反應混合物在室溫之下經攪拌 30 分鐘，被倒入冰/水中，經三級丁基甲醚萃取三次。有機層經 1N 鹽酸沖洗，經水沖洗二次，經硫酸鎂乾燥，在減壓之下蒸發溶劑，得到 4.92 克的結晶(熔點 80 至 82°C)，其供下一道步驟使用而不需要純化。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.66 (6H,s); 7.72 – 7.88 (4H,m); 9.6 (1H,s)。

步驟 3: 2-(1,3-二氧代-1,3-二氫-異吡啶-2-基)-2-甲基丙醛 O-甲基-肼之製備

1.35 克之 N-甲基羥基胺鹽酸和 1.33 克的乙酸钠被加入 3.53 克來自步驟 2 之 2-(1,3-二氧代-1,3-二氫-異吡啶-2-基)-2-甲基丙醛在 35 毫升乙醇和 10 毫升氯仿之溶液中，在室溫之下經攪拌 12 小時。以過濾移除鹽之後，在減壓之下除去溶劑。以層析術(矽膠：庚烷/乙酸乙酯為 4:1)純化粗製殘留物，製得 1.73 克固體產物 2-(1,3-二氧代-1,3-二氫-異吡啶-2-基)-2-甲基丙醛 O-甲基-肼。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 1.82(6H,s); 3.88 (3H,s); 7.65 – 7.73 (5H,m)。

步驟 4: 2-胺基-2-甲基-丙醛 O-甲基-肼之製備

來自上述步驟 3 之 1.72 克之 2-(1,3-二氧代-1,3-二氫-異吡啶-2-基)-2-甲基丙醛 O-甲基-肼和胼水合物之混合物被回流 2 小時。反應混合物經過濾，以移除酞醯胼，所得液體經蒸發而製得 240 毫克油，其供下一道

步驟(實施例 xx)使用而不需要純化。

實施例 3

本實施例例示根據流程 3 所顯示第二步驟製備 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲基硫基-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

328 毫克 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲基硫乙酸和 354 毫克三乙胺被溶於 10 毫升乙腈中，接著添加 150 毫克 HOBt 和 353 毫克 TBTU。反應混合物被攪拌 5 分鐘，然後加入來自上述步驟 4 之 209 毫克的粗製 2-甲基-丙醛 O-甲基-肟。在室溫之下攪拌反應混合物 15 小時之後，加入乙酸乙酯。加入水，以乙酸乙酯萃取水相。混合的有機萃取物被硫酸鎂乾燥，過濾和在減壓之下蒸發。經 HPLC 層析術得到 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲基硫基-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.81 (1H,d); 8.25 (1H,d); 8.05 (1H,d); 7.59(1H, s br); 7.46(1H,dd); 7.40(1H,d); 7.18 (1H,d); 5.64 (1H,s); 3.88(3H,s); 2.20(3H,s); 1.60(3H,s); 1.60 (3H,s)。

實施例 4

實施例 4 提供部分列於以上所引述表的化合物的 NMR 數據及/或熔點且已使用類似實施例 1 至 3 所述程序，除非特別特定。除非特別特定，所記載之 ^1H NMR 訊號為主要非對映異構物之特徵。

以下通式(1)之肟係使用類似於該等於實施例 1，第一階段步驟 1 和步驟 2 之程序，以苯並噻唑-6-醇(以如 WO 2004108663 A1 所述者製備)和氯-甲基硫基-乙酸甲酯為起始物加以製備。

第 1 號化合物：2-(苯並噻唑-6-基氧基)-N-(2-甲氧基-亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H, sm); 8.09 (1H, sm); 7.62 (1H, sm); 7.55 (1H, s br); 7.39 (1H, s); 7.13 (1H, sm); 5.62 (1H, s); 3.39 (3H, s); 2.20 (3H, s); 1.60 (3H, s); 1.58 (3H, s); 熔點為 158–161°C。

以下通式(1)之肟係使用類似於該等於實施例 1，第一階段步驟 1 和步驟 2 之程序，以 3-碘-喹啉-6-醇(以如 WO 2006058700 A1 所述者製備)和 2-氯-丁酸甲酯為起始物加以製備。

第 2 號化合物：2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基-亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-丁醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.91 (1H, d); 8.41 (1H, d); 8.00 (1H, d); 7.43 (1H, dd); 7.30 (1H, s); 7.17 (1H, s br); 6.97 (1H, d); 4.58 (1H, t); 3.76 (3H, s); 2.09–1.98 (2H, m); 1.49 (3H, s); 1.44 (3H, s); 1.08 (3H, t)。

第 3 號化合物：N-(2-乙氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-丁醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.91 (1H, d); 8.40 (1H, d); 7.99

(1H,d); 7.42(1H, d); 7.28(1H,s); 7.26(1H,s br); 6.97 (1H,d); 4.57 (1H,t) ; 4.05 – 3.93(2H,m) ; 2.10 – 1.98(2H,m) ; 1.50(3H,s) ; 1.44 (3H,s) ; 1.17(H,t) ; 1.08(3H,t)。

第 4 號化合物：N-(2-烯丙基氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-丁醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.91 (1H,d); 8.41 (1H,d); 7.98 (1H,d) ; 7.42(1H, dd) ; 7.32(1H,s) ; 7.20(1H,s br) ; 6.97 (1H,d) ; 5.93 – 5.84(1H,m) ; 5.24(1H,dd) ; 5.17(1H,dd) ; 4.57(1H,t) ; 4.44 (2H,d) ; 2.10 – 1.97(2H,m) ; 1.50(3H,s) ; 1.45(3H,s) ; 1.07(3H,t)。

以下通式(1)之脞係使用類似於該等於實施例 1，第一階段步驟 1 和步驟 2 之程序，以 3-碘-8-甲基喹啉-6-醇(以如 WO 2006058700 A1 所述者製備)和 2-氯-丁酸甲酯為起始物加以製備。

第 5 號化合物：2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基-亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-丁醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.91 (1H,d); 8.36 (1H,d); 7.31 (1H,s); 7.29(1H, d); 7.15(1H,s br); 6.80(1H,d); 4.56 (1H,t); 3.77(3H,s) ; 2.74(3H,s) ; 2.08 – 1.96(2H,m) ; 1.49 (3H,s) ; 1.44(3H,s) ; 1.07(3H,t)。

第 6 號化合物：N-(2-乙氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-丁醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.91 (1H,d); 8.36 (1H,s); 7.29

(1H,d); 7.29(1H, s); 7.24(1H,s br); 6.80(1H,d); 4.55 (1H,t); 4.44 (2H,d); 2.74(3H,s); 2.09 – 1.96(2H,m); 1.50(3H,s); 1.44 (3H,s); 1.06(3H,t)。

第 7 號化合物: N-(2-烯丙基氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-丁醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.91 (1H,d); 8.36 (1H,d); 7.35 (1H,s); 7.28(1H,d); 7.19(1H,s br); 6.80(1H,d); 5.94 – 5.84(1H,m); 5.24(1H,dd); 5.16(1H,dd); 4.55(1H,t); 4.44 (2H,d); 2.74(3H,s); 2.09 – 1.96(2H,m); 1.50(3H,s); 1.44(3H,s); 1.06(3H,t)。

以下通式(1)之肟係使用類似於該等於實施例 1，第一階段步驟 1 和步驟 2 之程序，以 3-溴-喹啉-6-醇(以如 Liebigs Ann Chem., 1966, 98-108 所述者製備)和氯-甲基硫基-乙酸甲酯為起始物加以製備。

第 8 號化合物: 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1,1-二甲基-2-苯氧基亞胺基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.20 (1H,d); 8.06 (1H,d); 7.84(1H,s); 7.58(1H,s br); 7.47(1H,dd); 7.33 – 7.04 (6H,m); 5.68(1H,s); 2.21(3H,s); 1.69(6H,s)。

第 9 號化合物: 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-[2-(4-氯-苄基氧基亞胺基)-1,1-二甲基-乙基]-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.83 (1H,d); 8.24 (1H,d); 8.04 (1H,d); 7.52(1H,s br); 7.49(1H,s); 7.36–7.26(6H,m); 7.15 (1H,d); 5.61(1H,s); 5.05(2H,s); 2.15(3H,s); 1.60(3H,s); 1.57(3H,s)。

第 10 號化合物: 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-[1,1-二甲基-2-(2,4,5-三氯-苄基氧基亞胺基)-乙基]-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.24 (1H,d); 8.02 (1H,d); 7.59(1H,s); 7.49(2H,d); 7.43(1H,s br); 7.36 (1H,dd); 7.16(1H,d); 5.62(1H,s); 5.13(2H,s); 2.16(3H,s); 1.60(3H,s); 1.58(3H,s)。

第 11 號化合物: 2-[2-[2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯基胺基]-2-甲基-亞丙-(E 或 Z)-基胺基氧基]-2-甲基-丙酸乙酯

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.28 (1H,d); 8.06 (1H,d); 7.70(1H,s br); 7.52(2H,dd); 7.45(1H,s); 7.22 (1H,d); 5.63(1H,s); 4.22–4.13(2H,m); 2.13(3H,s); 1.61(3H,s); 1.59(3H,s); 1.55(3H,s); 1.52(3H,s); 1.21(3H,t)。

第 12 號化合物: 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-三級丁氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.24 (1H,d); 8.04 (1H,d); 7.89(1H,s br); 7.44(1H,dd); 7.31(1H,s); 7.18 (1H,d); 5.65(1H,s); 2.19(3H,s); 1.61(3H,s); 1.53(3H,s);

1.30(9H,s)。

第 13 號化合物：N-(2-烯丙基氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫-乙醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.25 (1H,d); 8.04 (1H,d); 7.64(1H,s br); 7.44(1H,d); 7.18(1H,d); 6.04 – 5.94(1H,m); 5.64(1H,s); 5.35 – 5.23(2H,m); 4.57(2H,m); 2.19 (3H,s); 1.61(3H,s); 1.57(3H,s)。

第 14 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-丁氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.81 (1H,d); 8.24 (1H,d); 8.04 (1H,d); 7.71(1H,s br); 7.45(1H,dd); 7.39(1H,s); 7.17 (1H,d); 5.64(1H,s); 4.08(2H,t); 2.19(3H,s); 1.68 – 1.58(8H,m); 1.45 – 1.36(2H,m); 0.94(3H,t)。

第 15 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.81 (1H,d); 8.25 (1H,d); 8.05 (1H,d); 7.59(1H,s br); 7.46(1H,dd); 7.40(1H,d); 7.18 (1H,d); 5.64(1H,s); 3.88(3H,s); 2.20(3H,s); 1.60(3H,s); 1.60(3H,s)。

第 16 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-乙氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙

醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.25 (1H,d); 8.05 (1H,d); 7.69(1H,s br); 7.45(1H,dd); 7.39(1H,s); 7.18 (1H,d); 5.65(1H,s); 4.10(2H,q); 2.2(3H,s); 1.61(3H,s); 1.58(3H,s); 1.28(3H,t)。

第 17 號化合物: 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1,1-二甲基-2-丙-2-炔基氧基亞胺基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.25 (1H,d); 8.04 (1H,d); 7.59(1H,s br); 7.49(1H,s); 7.48(1H,dd); 7.20 (1H,d); 5.64(1H,s); 4.66(2H,s); 2.47(1H,t); 2.19(3H,s); 1.62(3H,s); 1.60(3H,s)。

第 18 號化合物: 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-異-丁氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.25 (1H,d); 8.04 (1H,d); 7.69(1H,s br); 7.45(1H,dd); 7.41(1H,s); 7.18 (1H,d); 5.64(1H,s); 3.83(2H,d); 2.19(3H,s); 2.05 - 1.93(1H,m); 1.59(3H,s); 1.58(3H,s); 0.95(6H,dd)。

第 19 號化合物: 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-羥基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.81 (1H,d); 8.25 (1H,d); 8.04 (1H,d); 7.92(1H,d); 7.55(1H,s br); 7.52(1H,s); 7.43

(1H,dd); 7.18(1H,d); 5.62(1H,s); 2.18(3H,s); 1.63(3H,s); 1.60(3H,s)。

以下通式(1)之肟係使用類似於該等於實施例 1，第一階段和第一階段之程序，以 3-溴-8-甲基喹啉-6-醇(以如 WO 2006058700 A1 所述者製備)和氯-甲基硫基-乙酸甲酯為起始物加以製備。

第 20 號化合物: 2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-[1,1-二甲基-2-(2,3,5-三氯-苄基氧基亞胺基)-乙基]-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.20 (1H,d); 7.61 (1H,s); 7.48(2H,d); 7.38(1H,s); 7.27(1H,d); 6.99 (1H,d); 5.61(1H,s); 5.11(2H,s); 2.76(3H,s); 2.16(3H,s); 1.60(3H,s); 1.58(3H,s)。

第 21 號化合物: 2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-[2-(4-氯-苄基氧基亞胺基)-1,1-二甲基-乙基]-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.20 (1H,d); 7.49 (1H,s); 7.46(1H,s br); 7.31-7.26(6H,m); 7.00(1H,d); 5.60 (1H,s); 5.04(2H,s); 2.77(3H,s); 2.16(3H,s); 1.59(3H,s); 1.57(3H,s)。

第 22 號化合物: 2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-三級-丁氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.20 (1H,d); 7.93

(1H, s br); 7.33(1H, d); 7.33(1H, s); 7.00(1H, d); 5.64 (1H, s); 2.75(3H, s); 2.18(3H, s); 1.61(3H, s); 1.56(3H, s); 1.31(9H, s)。

第 23 號化合物: 2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-(1,1-二甲基-2-苯氧基亞胺基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.81 (1H, d); 8.17 (1H, d); 7.84 (1H, s); 7.62(1H, s br); 7.34 – 7.30(3H, m); 7.17 – 7.01(4H, m); 5.66 (1H, s); 2.75(3H, s); 2.20(3H, s); 1.69(6H, s)。

第 24 號化合物: 2-[2-[2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯基胺基]-2-甲基-亞丙-(E)-基胺基氧基]-2-甲基丙酸乙酯

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.81 (1H, d); 8.23 (1H, d); 7.74 (1H, s br); 7.41(1H, s); 7.40(1H, d); 7.01(1H, d); 5.63 (1H, s); 4.25 – 4.08(2H, m); 2.80(3H, s); 2.12(3H, s); 1.62(3H, s); 1.59(3H, s); 1.55 (3H, s); 1.53(3H, s); 1.21(3H, t)。

第 25 號化合物: 2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-異丁氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H, d); 8.21 (1H, d); 7.70 (1H, s br); 7.41(1H, s); 7.30(1H, d); 7.01(1H, d); 5.63 (1H, s); 8.83(2H, d); 2.74(3H, s); 2.17(3H, s); 2.05 – 1.95(1H, m); 1.58 (3H, s); 1.57(3H, s); 0.94(6H, dd)。

第 26 號化合物: 2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧

基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基
 硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.21 (1H,d); 7.58 (1H, s br); 7.41(1H,s); 7.02(1H,d); 5.63 (1H,s); 3.88(3H,s); 2.77(3H,s); 2.20(3H,s); 1.60(3H,s); 1.58 (3H,s)。

第 27 號化合物: 2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-乙氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基
 硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.81 (1H,d); 8.21 (1H,d); 7.67 (1H, s br); 7.40(1H,s); 7.31(1H,d); 7.01 (1H,d); 5.63(1H,s); 4.14(2H,q); 2.74(3H,s); 2.19(3H,s); 1.61(3H,s); 1.58 (3H,s); 1.26(3H,t)。

第 28 號化合物: N-(2-烯丙基氧基亞胺基-1,1-二
 甲基-乙基)-2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-
 2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.21 (1H,d); 7.63 (1H, s br); 7.45(1H,s); 7.31(1H,d); 7.01 (1H,d); 6.05 – 5.95(1H,m); 5.62(1H,s); 5.35 – 5.23(2H,m); 4.58 – 4.56(2H,m); 2.77(3H,s); 2.19(3H,s); 1.60(3H,s); 1.58 (3H,s)。

第 29 號化合物: 2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-(1,1-二甲基-2-丙-2-炔基氧基亞胺基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.21 (1H,d); 7.58

(1H, s br); 7.50(1H,s); 7.36(1H,d); 7.02 (1H,d); 5.62(1H,s); 4.67(2H,s); 2.77(3H,s); 2.47(1H,t); 2.20(3H,s); 1.62 (3H,s); 1.60(3H,s)。

第 30 號化合物: 2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-丁氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.81 (1H,d); 8.21 (1H,d); 7.69 (1H, s br); 7.39(1H,s); 7.31(1H,d); 7.01(1H,d); 5.63 (1H,s); 4.07(2H,t); 2.72(3H,s); 2.19(3H,s); 1.70-1.55(8H,m); 1.45 (2H,m); 0.96(3H,t)。

第 31 號化合物: 2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-羥基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.81 (1H,d); 8.21 (1H,d); 7.65 (1H, s); 7.52(1H,s); 7.51(1H,s); 7.29(1H,d); 7.02 (1H,d); 5.62(1H,s); 2.75(3H,s); 2.18(3H,s); 1.62(3H,s); 1.60 (3H,s)。

第 32 號化合物: 2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-{2-[(E)-甲氧基亞胺基]-1,1-二甲基-丙基}-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.81 (1H,d); 8.33 (1H, s br); 8.20 (1H,d); 7.33(1H,d); 7.01(1H,d); 5.62(1H,s); 3.92 (3H,s); 2.77(3H,s); 2.20(3H,s); 1.85(3H,s); 1.62 (3H,s)。

以下通式(1)之肟係使用類似於該等於實施例 1, 第一階段步驟 1 和步驟 2 之程序, 以 3,8-二溴-喹啉-6-醇(以

如 WO 2004047538 A1 所述者製備)和氯-甲基硫基乙酸甲酯為起始物加以製備。

第 33 號化合物：2-(3,8-二溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-乙氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.92 (1H,d); 8.28 (1H,d); 7.83 (1H,d); 7.68(1H,s br); 7.39(1H,s); 7.17(1H,d); 5.63 (1H,s); 4.15(2H,q); 2.19(3H,s); 1.59(3H,s); 1.56 (3H,s); 1.30(3H,t)。

第 34 號化合物：2-(3,8-二溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.92 (1H,d); 8.28 (1H,d); 7.85 (1H,d); 7.59(1H,s br); 7.40(1H,s); 7.17(1H,d); 5.63 (1H,s); 3.90(3H,s); 2.20(3H,s); 1.58(6H,s)。

以下通式(1)之肱係使用類似於該等於實施例 1，第一階段步驟 1 和步驟 2 之程序，以 3-溴-8-氯-喹啉-6-醇(以如 WO 2004108663 A1 所述者製備)和氯-甲基硫基乙酸甲酯為起始物加以製備。

第 35 號化合物：2-(3-溴-8-氯-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.92 (1H,d); 8.28 (1H,d); 8.63 (1H,d); 8.59(1H,s br); 7.40(1H,s); 7.13(1H,d); 5.63 (1H,s); 3.90(3H,s); 2.20(3H,s); 1.58(3H,s); 1.57(3H,s)。

第 36 號化合物：2-(3-溴-8-氯-喹啉-6-基氧基)-N-(2-乙氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.92 (1H,d); 8.27 (1H,d); 7.68 (1H,s br); 7.56(1H,d); 7.39(1H,s); 7.17(1H,d); 5.63 (1H,s); 4.17(2H,q); 2.20(3H,s); 1.61(3H,s); 1.58(3H,s); 1.30(3H,t)。

以下通式(1)之喹啉-6-醇衍生之肟係製備於 3-溴-喹啉-6-醇、3-碘-喹啉-6-醇或 3-乙炔基喹啉-6-醇和氯-甲基硫基-乙酸甲酯或直接製備自 2-(3-溴或碘-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺，如以下實施例 5 所述：

實施例 5

此實施例係例示自(3-溴-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸甲酯製備 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

步驟 1：甲基硫基-(3-三甲基矽烷基乙炔基-喹啉-6-基氧基)-乙酸甲酯

(3-溴-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸甲酯(9.5 克)，雙(鈹(II)三苯基膦)二氯化物(877 毫克)，碘化銅(200 毫克)和二異丙基胺(17.5 毫升)被溶於四氫呋喃(150 毫升)，並氬氣脫氧。於 10 分鐘滴加三甲基矽烷基乙炔(7.1 毫升)。將反應混合物加熱至 45°C ，在該溫度之下攪拌 36 小時。以

乙酸乙酯稀釋反應混合物，以 2x200 毫升飽和氯化鈉水溶液沖洗。以 2x500 毫升乙酸乙酯萃取水層。所有有機相被合併，於硫酸鎂乾燥，過濾並蒸發。殘留物經管柱層析術(庚烷/乙酸乙酯為 4:1)純化，製得甲基硫基-(3-三甲基矽烷基乙炔基-喹啉-6-基氧基)-乙酸甲酯之黃色油(7.6 克)。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.81 (1H,d); 8.16 (1H,d); 8.03 (1H,d); 7.48(1H,dd); 7.17(1H,d); 5.73(1H,s); 3.88 (3H,s); 2.24(3H,s); 0.29(9H,s)。

步驟 2: (3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸

對來自步驟 1 之甲基硫基-(3-三甲基矽烷基乙炔基-喹啉-6-基氧基)-乙酸甲酯之黃色油(5 克)於乙醇(50 毫升)中之溶液，加入氫氧化鈉在水(9.74 毫升)中之 2M 溶液。在室溫之下攪拌反應混合物 1 小時。將反應混合物倒入冰冷水(200 毫升)中，以氫氯酸在水(9.74 毫升)中之 2M 溶液予以酸化。過濾沉澱物，以水沖洗，得到(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸之淺黃色固體(3.53 克)。

^1H NMR (DMSO) δ ppm: 13.45 (1H,s); 8.73 (1H,d); 8.37(1H,d); 7.93(1H,d); 7.51(1H,d); 7.47(1H,d); 6.03 (1H,s); 4.45(1H,s); 2.11(3H,s)。

步驟 3: 使用類似於所提供實施例 3 之程序，以來自實施例 2 步驟 4 之 2-甲基-丙醛 O-甲基-肟使來自以上步

驟 2 之 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺行醯胺化

第 38 號化合物：2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.86 (1H,d); 8.21 (1H,d); 8.06 (1H,d); 7.59(1H,s br); 7.47(1H,dd); 7.41(1H,s); 7.23 (1H,d); 5.65(1H,s); 3.88(3H,s); 3.29(1H,s); 2.20(3H,s); 1.60(3H,s); 1.58(3H,s)。

或者，第 38 號化合物 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺可經由第 37 號化合物 N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基 2-(3-三甲基矽烷基乙炔基-喹啉-6-基氧基)-乙醯胺 $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.17 (1H,d); 8.04 (1H,d); 7.60(1H,s br); 7.45(1H,dd); 7.41(1H,s); 7.21 (1H,d); 5.64(1H,s); 3.88(3H,s); 2.20(3H,s); 1.60(3H,s); 1.58(3H,s); 0.30(9H,s) 之脫矽烷作用，經在甲醇中之碳酸鉀處理 1 小時而製備。反應混合物經乙酸乙酯稀釋，以飽和水性碳酸氫鈉沖洗，水層經乙酸乙酯萃取三次，合併有機層，於硫酸鈉乾燥，過濾，在真空中蒸發，經管柱層析術純化，得到第 38 號化合物。第 37 號化合物可直接製備於實施例 3 之 2-(3-溴喹啉基-6-氧基)-2-甲基硫基-N-(2-甲氧基亞胺基

—1,1—二甲基乙基)乙醯胺，如實施例 5 步驟 1 所述。

除此之外，第 38 號化合物(2—(3—乙炔基—喹啉—6—基氧基)—N—(2—甲氧基亞胺基—1,1—二甲基—乙基)—2—甲基硫基—乙醯胺)可使用類似於該等敘述於實施例 1、第 1 階段和第 2 階段之程序，以 3—三甲基矽烷基乙炔基—喹啉—6—醇[C₁₄H₁₅NOSi, m/z 241](製備於如實施例 5、步驟 1 所述之 3—溴—喹啉—6—醇和三甲基矽烷基乙炔)和氯—甲基硫基—乙酸甲酯為起始物加以製備。

或者，第 38 號化合物(2—(3—乙炔基—喹啉—6—基氧基)—N—(2—甲氧基亞胺基—1,1—二甲基—乙基)—2—甲基硫基—乙醯胺)可使用類似於該等敘述於實施例 1、第 1 階段之程序，以 3—乙炔基—喹啉—6—醇[C₁₁H₇NO, m/z 169](製備於如實施例 5、步驟 1 和步驟 2 所述之 3—溴—喹啉—6—醇和三甲基矽烷基乙炔)和氯—甲基硫基—乙酸甲酯為起始物加以製備。

實施例 6

實施例 6 提供部分列於以上所引述表的化合物的 NMR 數據及/或熔點且已使用類似實施例 1 至 3 所述程序，除非特別特定。除非特別特定，所記載之 ¹H NMR 訊號為主要非對映異構物之特徵。

以下通式(1)之肟係使用類似於該等敘述於實施例 1、第一階段和第二階段之程序，製備於 3—碘—8—甲基—喹啉—6—醇和氯—甲基硫基—乙酸甲酯。

第 39 號化合物：N—(3—丁氧基亞胺基—1,1—二甲基

—丙基)—2—(3—碘—8—甲基—喹啉—6—基氧基)—2—
甲基硫基—乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.95 (1H,s); 8.44 (1H,s); 7.40 (1H,t,異構物 A); 7.32(1H,s); 6.98(1H,s); 6.75(1H,s, 異構物 B)(—NH); 6.72(1H,t, 異構物 B); 6.65(1H,s, 異構物 A)(—NH); 5.59(1H,s, 異構物 A); 5.55(1H,s, 異構物 B); 4.11(2H,t, 異構物 B); 4.02(2H,t, 異構物 A); 2.83(2H,t, 異構物 B); 2.78(3H,s); 2.65(2H,d, 異構物 A); 2.21(3H,s, 異構物 B); 2.19(3H,s, 異構物 A); 1.73—1.56(2H,m); 1.47(6H,s); 1.51—1.30(2H,m); 0.98—0.85(3H,m)。

第 40 號化合物: N—(3—烯丙基氧基亞胺基—1,1—二
甲基—丙基)—2—(3—碘—8—甲基—喹啉—6—基氧基)—
2—甲基硫基—乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.94 (1H,s); 8.40 (1H,s); 7.42 (1H,t,異構物 A); 7.29(1H,s); 6.76(1H,t, 異構物 B); 6.72(1H,s, 異構物 B)(—NH); 6.60(1H,s, 異構物 A); 6.04—5.88(1H,m); 5.58(1H,s, 異構物 A); 5.54(1H,s, 異構物 B); 5.32—5.17(2H,m); 4.60(2H,sd, 異構物 B); 4.50(2H,s, 異構物 A); 2.91—2.78(2H,m); 2.76(3H,s); 2.67(2H,d, 異構物 A); 2.20(3H,s); 1.47(3H,s, 異構物 B); 1.45(3H,s, 異構物 A)。

第 41 號化合物: N—(3—羥基亞胺基—1,1—二甲基—
丙基)—2—(3—碘—8—甲基—喹啉—6—基氧基)—2—甲
基硫基—乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.99 (1H,s); 8.47 (1H,s); 7.45 (1H,t,異構物 A); 7.35(1H,s); 6.99(1H,s); 6.96(1H,s, 異構物 B)(-NH); 6.84(1H,t, 異構物 B); 6.59(1H,s, 異構物 A)(-NH); 5.59(1H,s, 異構物 A); 5.57(1H,s, 異構物 B); 2.87(2H,t, 異構物 B); 2.80(3H,s); 2.70(2H,d, 異構物 A); 2.20(3H,s); 1.53(6H,s, 異構物 A); 1.51(6H,s, 異構物 B)。

第 42 號化合物: N-(2-乙氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.94 (1H,d); 8.42 (1H,d); 7.64 (1H,s br); 7.40(1H,s); 7.31(1H,d); 6.97(1H,d); 5.61(1H,s); 4.13(2H,q); 2.75(3H,s); 2.17(3H,s); 1.60(3H,s); 1.57(3H,s); 1.28(3H,t)。

第 43 號化合物: N-(3-三級-丁氧基亞胺基-1,1-二甲基-丙基)-2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.95 (1H,s); 8.41 (1H,s); 7.38 (1H,t,異構物 A); 7.30(1H,s); 6.97(1H,s); 6.70(1H,t, 異構物 B); 6.59(1H,s)(-NH); 5.57(1H,s, 異構物 A); 5.52(1H,s, 異構物 B); 2.88-2.79(2H,m, 異構物 B); 2.77(3H,s); 2.70-2.59(2H,d, 異構物 A); 2.21(3H,s, 異構物 B); 2.17(3H,s, 異構物 A); 1.47(6H,s); 1.29(9H,s, 異構物 B); 1.25(9H,s, 異構物 A)。熔點為 130-131°C。

第 44 號化合物: 2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧

基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.94 (1H,d); 8.42 (1H,d); 7.55 (1H,s br); 7.41(1H,s); 7.32(1H,d); 6.98(1H,d); 5.61(1H,s); 3.88(3H,s); 2.76(3H,s); 2.18(3H,s); 1.60(3H,s); 1.57(3H,s)。

第 45 號化合物: N-(2-烯丙基氧基亞胺基-1,1-二甲基-丙基)-2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.95 (1H,d); 8.42 (1H,d); 7.60 (1H,s br); 7.46(1H,s); 7.31(1H,d); 6.97(1H,d); 6.04 - 5.94(1H,m); 5.61(1H,s); 5.33(1H,dd); 5.23(1H,dd); 4.57(2H,d); 2.76(3H,s); 2.17(3H,s); 1.62(3H,s); 1.58(3H,s)。

以下通式(1)之胈係使用類似於該等敘述於實施例 1、第一階和第二階段之程序，製備於 3-碘-喹啉-6-醇和氯-甲基硫基-乙酸甲酯。

第 46 號化合物: 2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-N-(3-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-丙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.95 (1H,s); 8.47 (1H,s); 8.02 (1H,d); 7.45(1H,dd); 7.37(1H,t, 異構物 A); 7.15(1H,s), 6.83(1H,s, 異構物)(-NH); 6.74(1H,t, 異構物); 6.60(1H,s, 異構物 A)(-NH); 5.58(1H,s, 異構物); 5.54(1H,s, 異構物 B); 3.89(3H,s, 異構物 B); 3.80(3H,s, 異構物); 2.85 - 2.68(2H,m, 異構物 B); 2.65(2H,d, 異構物

A); 2.20(3H,s, 異構物); 2.19(3H,s, 異構物 A); 1.43(6H,s)。

熔點為 117–118°C。

第 47 號化合物：N-(3-苄基氧基亞胺基-1,1-二甲基-丙基)-2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.96 (1H,s); 8.41 (1H,dd); 7.48 (1H,t, 異構物 A); 7.40–7.26(6H,m); 6.96(1H,dd); 6.68(1H,t, 異構物 B); 6.70(1H,s, 異構物 B)(–NH); 6.60(1H,s, 異構物 A)(–NH); 5.57(1H,s, 異構物 A); 5.52(1H,s, 異構物 B); 5.15(2H,s, 異構物 B); 5.08(2H,s, 異構物 A); 2.97–2.81(2H,m, 異構物 B); 2.75(3H,s); 2.68(2H,d, 異構物 A); 2.19(3H,s); 1.47(3H,s, 異構物 B); 1.44(3H,s, 異構物 A)。

第 48 號化合物：2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-N-(3-甲氧基亞胺基-1-甲基-丙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.95 (1H,s); 8.43 (1H,s); 7.40 (1H,t, 異構物 B); 7.31(1H,s); 6.95(1H,s); 6.75(1H,t)(–NH); 6.68(1H,t, 異構物 A); 5.66(1H,s, 異構物 B); 5.62(1H,s, 異構物 A); 4.36–4.24(1H,m); 3.84(3H,d, 異構物 B); 3.76(3H,d, 異構物 A); 2.76(3H,s); 2.51–2.34(2H,m); 2.18(3H,s, 異構物 A); 2.2.15(3H,s, 異構物 B); 1.31(3H,s, 異構物 A); 1.26(3H,s, 異構物 B)。

第 49 號化合物：2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-N-{3-[(E&Z)-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-丙基]-2-甲

基 硫 基 - 乙 醯 胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.80 (1H,s); 8.24 (1H,s); 8.03 (1H,d), 7.77(1H,s, 異構物 B)(-NH); 7.48(1H,dd); 7.35(1H,s, 異構物 B)(-NH); 7.18(1H,sd); 5.58(1H,s, 異構物 A); 5.49(1H,s, 異構物 B); 3.87(3H,s, 異構物 B); 3.82(3H,s, 異構物 A); 2.52-2.42(2H,m); 2.21(3H,s, 異構物 B); 2.18(3H,s, 異構物 A); 1.94(3H,s, 異構物 B); 1.88(3H,s, 異構物 A); 1.49(6H,s, 異構物 B); 1.47(6H,s, 異構物 A)。

第 50 號化合物: 2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.95 (1H,d); 8.47 (1H,d); 8.03 (1H,d); 7.59(1H,s br); 7.46(1H,dd); 7.40(1H,s); 7.15(1H,d); 5.64(1H,s); 3.88(3H,s); 2.20(3H,s); 1.60(3H,s); 1.58(3H,s)。

第 51 號化合物: N-(2-乙氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.94 (1H,d); 8.46 (1H,d); 8.03 (1H,d); 7.66(1H,s br); 7.44(1H,dd); 7.39(1H,s); 7.14(1H,d); 5.63(1H,s); 4.12(2H,q); 2.19(3H,s); 1.61(3H,s); 1.58(3H,s); 1.28(3H,t)。

第 52 號化合物: N-(2-烯氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.95 (1H,d); 8.47 (1H,d); 8.02 (1H,d); 7.61(1H,d); 7.45(1H,s); 7.45(1H,dd); 7.14(1H,d); 6.03 – 5.94(1H,m); 5.63(1H,s); 5.32(1H,dd); 5.24(1H,dd); 4.57(2H,d); 2.19(3H,s); 1.61(3H,s); 1.58(3H, s)。

實施例 7

本實施例例示製備 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1-氰基-2-甲氧基亞胺基-1-甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(第 53 號化合物)

第一階段:根據流程 15 所示第二步驟製備 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1-氰基-2-羥基-1-甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

在室溫之下,將 0.86 毫升三乙胺, 0.672 克 1-羥基-7-氮雜苯並三唑和 0.946 克之 N-(3-二甲基胺基丙基)-N'-乙基碳化二醯亞胺.HCl 加入 1.35 克(3-溴-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸在 11 毫升無水四氫呋喃中之懸浮液中。將溶於 2 毫升無水四氫呋喃中之 0.494 克 2-胺基-3-羥基-2-甲基丙腈滴加入此懸浮液中。反應混合物在室溫之下攪拌 16 小時,然後被倒入乙酸乙酯和鹽水之混合物中。分離該二層,以乙酸乙酯萃取水層三次。合併有機層,以鹽水沖洗一次,於硫酸鈉乾燥。在過濾之後,在真空之下予以濃縮,分離 1.886 克呈暗橙色油之粗製混合物。粗製混合物經快速層析術於矽膠上(己烷/乙酸乙酯)純化而製得 1.103 克 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1-氰基-2-羥基-1-甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯

胺與來自均(homo)偶合方法之 3-(3-溴-喹啉-6-基)-2-甲基硫基-丙酸 2-[2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯基胺基]-2-氰基-2-甲基乙酯之混合物。此混合物被溶於 19 毫升四氫呋並於 0°C 經 2 毫升氫氧化鈉溶液(1N)處理 1 小時。此粗製混合物經乙酸乙酯萃取(pH=11)三次。合併有機層，以鹽水沖洗一次，然後，於硫酸鈉乾燥。在過濾之後，在減壓之下濃縮，殘留物經快速層析術於矽膠上(己烷/乙酸乙酯)純化而製得 0.669 克呈淺黃色不定型固體之 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1-氰基-2-羥基-1-甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,m); 8.24 (1H,d); 8.03 (1H,dd), 7.46(1H,dm)[{7.22(s br), 7.17(s,br)}, 異構物 A 和異構物 B]; 7.22(1H,m); [{5.74(s), 5.71(s)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; 4.08-3.82(2H,m); 3.40(1H,s,br); 2.21(3H,s); [{1.80(s), 1.78(s, 3H), 異構物 A 和異構物 B}].

第二階段:根據流程 15 所示第四步驟製備 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1-氰基-1-甲基-2-氧代-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

來自上述第一階段之 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1-氰基-2-羥基-1-甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(0.660 克)在二氯甲烷(25 毫升)中經 Dess-Martin 高碘烷(0.819 克)處理。此反應混合物於室溫之下經攪拌 2 小時 30 分鐘。此反應混合物經飽和碳酸氫鈉水溶液和硫代硫

酸鈉水溶液驟冷。反應混合物於室溫之下經激烈攪拌 30 分鐘。之後，分離二相。有機層經飽和碳酸氫鈉水溶液沖洗。分離有機相之後，於硫酸鈉乾燥，過濾和蒸發，製得 0.397 克 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1-氰基-1-甲基-2-氧代-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺粗製產物，其供下一道步驟使用而不需要任何純化。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm[{9.51(s), 9.49(s)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; 8.87(1H,d); 8.28(1H, d); 8.07(1H, d); 7.48(1H, dd); [{7.44(s br), 7.39(s br)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; 7.21(1H,d); 5.81(1H,s); 2.21(3H,s); [{1.89(s), 1.87(s) 3H} , 異構物 A 和異構物 B]。

第三階段:根據流程 15 所示第五步驟製備 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1-氰基-2-甲氧基亞胺基-1-甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(第 53 號化合物)

來自上述第二階段所得之 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1-氰基-1-甲基-2-氧代-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(0.430 克)，吡啶(0.178 克)和 O-甲基-羥基胺鹽酸鹽(0.185 克)於無水甲醇(10 毫升)於室溫之下經攪拌 16 小時。反應混合物經乙酸乙酯稀釋，倒入飽和碳酸氫鈉(50 毫升)。分離此二相，以乙酸乙酯萃取水層三次。混合的有機層經硫酸鎂乾燥，過濾和蒸發。殘留物經與甲苯共同蒸發，然後，經管柱層析術(庚烷/乙酸乙酯為 1:1 至 1:2)純化，製得 0.245 克呈白色固體之 2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1-氰基-2-甲氧基亞胺基-1-甲基-

乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(第 53 號化合物)(熔點為 138 至 145°C)。

以下通式(1)之肟係使用類似於該等敘述於實施例 7、第一階段至第三階段之程序，自相對應之經取代之喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸和 2-胺基-3-羥基-2-甲基丙腈製備。

第 54 號化合物：2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-(1-氰基-2-甲氧基亞胺基-1-甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：熔點為 156 至 159°C。

第 55 號化合物：N-(1-氰基-2-甲氧基亞胺基-1-甲基-乙基)-2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：熔點為 166 至 168°C。

第 56 號化合物：N-(1-氰基-2-甲氧基亞胺基-1-甲基-乙基)-2-(3-乙炔基-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：熔點為 172 至 174°C。

第 57 號化合物：N-(1-氰基-2-甲氧基亞胺基-1-甲基-乙基)-2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：熔點為 59 至 64°C。

第 58 號化合物：N-(1-氰基-2-甲氧基亞胺基-1-甲基-乙基)-2-甲基硫基-2-(3-三甲基矽烷基乙炔基-喹啉-6-基氧基)-乙醯胺：熔點為 69 至 75°C。

第 59 號化合物：N-(1-氰基-2-甲氧基亞胺基-1-甲基-乙基)-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：熔點為 58 至 65°C。

以下通式(1)之脂肪係使用類似於該等敘述於實施例 7、第一階段至第三階段之程序，自相對應之經取代之喹啉-6-基氧基丁酸和 2-胺基-3-羥基-2-甲基丙腈製備。

第 60 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(1-氰基-2-甲氧基亞胺基-1-甲基-乙基)-丁醯胺：熔點為 152 至 155°C。

第 61 號化合物：N-(1-氰基-2-甲氧基亞胺基-1-甲基-乙基)-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-丁醯胺：熔點為 146 至 148°C。

實施例 8

本實施例例示根據流程 10 和 11 製備 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1-甲基-1-丙-2-炔氧基甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(第 62 號化合物)

第一階段：製備 3-甲基-3-丙-2-炔基氧基甲基-1-氧雜-4-氮雜-螺[4,5]癸烷

氫化鈉(55%於油中之分散液)(0.636 克)被分批於 0°C 加入(3-甲基-1-氧雜-4-氮雜-螺[4,5]癸-3-基)-甲醇(2.0 克)在無水四氫呋喃(30 毫升)中之溶液。反應混合物於室溫之下被攪拌 50'。於 0°C 滴加炔丙基溴化物(0.972 毫升)，所得混合物於室溫之下被攪拌 2 小時 30 分鐘。於 0°C 加入額外的氫化鈉(55%於油中之分散液)(0.047 克)和炔丙基溴化物(0.081 毫升)，接著於 40 至 45°C 加熱反應混合物 1 小時，使其達到反應完成。反應混合物經無水乙醇(4 毫升)

處理，經二乙醚稀釋。所得不溶解的殘留物經過濾，濾液於真空之下被濃縮，得到 2.89 克粗製殘留物，經管柱層析術(庚烷/乙酸乙酯為 1:1)純化，得到 2.33 克為橙色液體之 3-甲基-3-丙-2-炔基氧基甲基-1-氧雜-4-氮雜-螺[4,5]癸烷。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 4.18 (2H,d); 3.82 (1H,d); 3.53 (1H,d); 3.43(1H,d); 3.38(1H,d); 2.42(1H,t); 1.7 – 1.2(10H,m); 1.25(1H,s)。

第二階段:製備 2-胺基-2-甲基-3-丙-2-炔基氧基-丙-1-醇鹽酸鹽

3-甲基-3-丙-2-炔基氧基甲基-1-氧雜-4-氮雜-螺[4,5]癸烷(1.83 克)於鹽酸之水溶液(6N)(2.873 毫升)中被回流 1 小時。反應混合物經冷卻至室溫，以水稀釋，經乙醚萃取三次。分離二層，在減壓之下濃縮水層，另外以甲苯進行共同蒸發，得到為灰白色固體之 2-胺基-2-甲基-3-丙-2-炔基氧基-丙-1-醇鹽酸鹽(1.205 克)，其供下一道步驟使用而不需要另外純化。

^1H NMR (DMSO) δ ppm: 8.02 (3H,s br); 5.47 (1H,s br); 4.21(2H,s); 3.54 – 3.49(5H,m); 1.15(3H,s)。

第三階段:製備 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-羥基-1-甲基-1-丙-2-炔基氧基甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

室溫之下，將 1-羥基-7-氮雜苯三唑(0.717 克)，O-(1H-苯並三唑-1-基)-N,N',N'-脲鹽四氟硼

酸鹽(1.692 克)和 2-氨基-2-甲基-3-丙-2-炔基氧基-丙-1-醇鹽酸鹽(0.947 克)加入三乙胺(2.14 毫升)和(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙(1.20 克)在 43 毫升無水二甲基甲醯胺之溶液中。反應混合物在室溫之下經攪拌 16 小時，然後被倒入乙酸乙酯和鹽水之混合物中。分離此二相，以乙酸乙酯萃取水層三次。混合有機層，以飽和碳酸氫鈉沖洗(1X)，以水沖洗(1X)和鹽水沖洗(1X)，然後經硫酸鈉乾燥。在減壓之下過濾和濃縮，經分離而得到 2.01 克呈暗橙色油之粗製混合物。粗製混合物經快速層析術於矽膠上(庚烷/乙酸乙酯)進行純化，製得 1.22 克 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-羥基-1-甲基-1-丙-2-炔基氧基甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺與來自均偶合方法之(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸 2-[2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯基胺基]-2-甲基-3-丙-2-炔基氧基-丙酯之混合物。此殘留物經溶於 24 毫升四氫呋喃/水(1/1)，在室溫之下經 42 毫克 LiOH 單水合物處理 1 小時 45 分鐘。此粗製混合物經乙酸乙酯萃取(pH=11)三次。合併有機層，以水沖一次，鹽水沖洗一次，然後，於硫酸鈉乾燥。在減壓之下過濾和濃縮之後，製得粗製的 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-羥基-1-甲基-1-丙-2-炔基氧基甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(0.944 克)的黃油，且供下一道步驟使用而不需要另外純化。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.88 (1H,d); 8.22 (1H,d); 8.07

(1H,d), 7.49(1H,dd); 7.39(1H, sbr); 7.22(1H, m); 5.68(1H, s); 4.22–4.16(2H, m); 3.90(1H, s br); 3.81–3.60(4H, m); 3.30(1H, s); 2.45(1H, dt); [{2.22(s), 2.20(s)3H}, 異構物 A 和異構物 B]; [{1.40(s), 1.34(s)3H}, 異構物 A 和異構物 B]。

第四階段: 製備 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(1-甲基-2-氧代-1-丙-2-炔基氧基甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

來自上述第三階段 1 之 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-羥基-1-甲基-1-丙-2-炔基氧基甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(1.0 克)在二氯甲烷(40 毫升)中經 Dess-Martin 高碘烷(1.277 克)處理。反應混合物在室溫之下經攪拌 2 小時 30 分鐘，然後，反應混合物經飽和水性碳酸氫鈉和飽和水性硫代硫酸鈉驟冷。反應混合物在室溫之下經激烈攪拌 30 分鐘，之後，分離此二相，有機層經飽和水性碳酸氫鈉沖洗，分離有機相之後，以硫酸鈉乾燥，經過濾和蒸發，製得 1.10 克粗製產物 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(1-甲基-2-氧代-1-丙-2-炔基氧基甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(伴隨著少量雜質)。此粗製混合物供下一道步驟使用而不需要另外純化。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm[{9.51(s), 9.49(s)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; 8.86(1H,d); 8.22(1H, d); 8.07(1H, d); 7.53–7.50(1H, m); [{7.58(s br), 7.48(s br)1H}, 異構物 A

和異構物 B]；7.26(1H,d)；5.72(1H,s)；4.16—3.87(4H,m)；3.28(1H，s)；2.48(1H，m)；[{2.22(s)，2.20(s) 3H)，異構物 A 和異構物 B]；1.52(3H，s)。

第五階段：製備 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1-甲基-1-丙-2-炔氧基甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

得自於上述第四階段所述之粗製 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(1-甲基-2-氧代-1-丙-2-炔基氧基甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(0.995 克)，吡啶(0.40 毫升)和 O-甲基-羥基胺鹽酸鹽(0.419 克)於無水甲醇(60 毫升)中於室溫之下攪拌 18 小時。反應混合物經乙酸乙酯稀釋，倒入飽和碳酸氫鈉(60 毫升)。分離此二相，以乙酸乙酯萃取水層三次。混合的有機層經硫酸鈉乾燥，過濾和蒸發。殘留物經與甲苯共同蒸發，然後，經管柱層析術(庚烷/乙酸乙酯為 3：2 至 1：1)純化，製得 0.81 克呈無色油之 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1-甲基-1-丙-2-炔氧基甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺。

第 62 號化合物： ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm 8.86(1H,d)；8.21(1H,d)；8.05(1H,d)；[{7.68(s br)，7.59(s br)1H}，異構物 A 和異構物 B]；7.44—7.49(2H,m)；7.21(1H，d)；5.65(1H，s)；4.12—4.19(2H，m)；3.73—4.0(2H，m)；[{3.90(s)，3.88(s)，3H}，異構物 A 和異構物 B]；3.29(1H,s)；2.43(1H,s)；2.20(3H,s)；[{1.55(s)，1.53(s) 3H)，異構物 A

和異構物 B]。

以下通式(1)之肟係使用類似於該等敘述於實施例 8、第一階段至第三階段之程序，自(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸和 2-胺基-3-甲氧基-2-甲基-丙-1-醇鹽酸鹽加以製備。

第 63 號化合物：2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1-甲氧基甲基-1-甲基-乙基)-甲基硫基乙醯胺。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm 8.82(1H,d) ; 8.21(1H,d) ; [{ 7.68(s br) , 7.58(s br) 1H } , 異構物 A 和異構物 B] ; [{ 7.50(s) , 7.45(s) 1H } , 異構物 A 和異構物 B] ; 7.33(1H,d) ; 7.03(1H , d) ; 5.66(1H , s) ; 3.90(3H , s) ; 3.60-3.90(2H , m) ; [{ 3.38(s) , 3.36(s) , 3H } , 異構物 A 和異構物 B] ; 2.78(3H,s) ; 2.22(3H,s) ; [{ 1.59(s) , 1.58(s) 3H } , 異構物 A 和異構物 B] 。熔點為 102 至 103 $^{\circ}\text{C}$ 。

以下通式(1)之肟係使用類似於該等敘述於實施例 7、第三階段至第五階段之程序，自(3-溴-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸和 2-胺基-3-甲氧基-2-甲基-丙-1-醇鹽酸鹽加以製備。

第 64 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基-1-(甲氧基亞胺基甲基)-1-甲基-乙基)-甲基硫基乙醯胺。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm 8.74(1H,d) ; 8.17(1H,d) ; 7.98(1H,d) [{ 7.61(s br) , 7.52(s br) 1H } , 異構物 A 和異構物

B] ; [{ 7.36(s) , 7.40(s) 1H } , 異構物 A 和異構物 B] ;
 7.38(1H,m); 7.12(1H, s, br); 5.58(1H, s); [{ 3.81(s), 3.81(s),
 3H } , 異構物 A 和異構物 B]; 3.50 – 3.81(2H,m); [{ 3.29(s) ,
 3.27(s) 3H) , 異構物 A 和異構物 B]; 2.13(3H,s); [{ 1.50(s) ,
 1.49(s) 3H) , 異構物 A 和異構物 B] 。

以下通式(1)之肟係使用類似於該等敘述於實施例 7、
 第三階段至第五階段之程序，自(3-乙炔基-喹啉-6-基
 氧基)-甲基硫基-乙酸和 2-胺基-3-甲氧基-2-甲基
 -丙-1-醇鹽酸鹽加以製備。

第 65 號化合物：2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)
 -N-(2-甲氧基亞胺基-1-甲氧基甲基-1-甲基-乙
 基)-甲基硫基乙醯胺。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm 8.86(1H,d) ; 8.22(1H,d) ;
 8.06(1H,d) [{ 7.70(s br) , 7.61(s br) 1H } , 異構物 A 和異構物
 B] ; [{ 7.45(s) , 7.49(s) 1H } , 異構物 A 和異構物 B] ;
 7.48(1H,m) ; 7.24(1H, s, br) ; 5.58(1H, s) ; 3.90(s,3H) ;
 3.59 – 3.90(2H, m) ; [{ 3.38(s) , 3.35(s) , 3H } , 異構物 A 和
 異構物 B] ; 3.31(1H,s) ; 2.22(3H,s) ; [{ 3.38(s) , 3.35(s)
 3H) , 異構物 A 和異構物 B] ; 3.31(1H,s) ; 2.22(3H,s) ;
 [{ 1.59(s) , 1.58(s) 3H) , 異構物 A 和異構物 B] 。

以下通式(1)之肟係使用類似於該等敘述於實施例 7、
 第三階段至第五階段之程序，自(3-乙炔基-喹啉-6-基
 氧基)-甲基硫基-乙酸和 2-胺基-3-甲氧基-2-甲基
 -丙-1-醇鹽酸鹽加以製備。

第 66 號化合物：2-(3-乙炔基-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1-甲氧基甲基-1-甲基-乙基)-甲基硫基乙醯胺。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm 8.83(1H,d) ; 8.15(1H,d) ;
 [{7.68(s br), 7.58(s br)1H} , 異構物 A 和異構物 B] ;
 [{7.68(s, br), 7.58(s, br)1H} , 異構物 A 和異構物 B] ;
 [{7.46(s) ; 7.41(s)H} , 異構物 A 和異構物 B] ; 7.31(1H, s, br) ; 7.04(1H, s, br) ; 5.64(1H, s) ; 3.87(s, 3H) ; 3.56-3.87(2H, m) ; [{3.35(s), 3.32(s), 3H} , 異構物 A 和異構物 B] ; 3.27(1H, s) ; 2.76(3H,s) ; 2.18(3H, s) ; [{1.56(s), 1.54(s) 3H} , 異構物 A 和異構物 B] 。

以下通式(1)之脞係使用類似於該等敘述於實施例 7、第三階段至第五階段之程序，自(3-碘-喹啉-6-基氧基)-1-甲基硫基-乙酸和 2-胺基-3-甲氧基-2-甲基-丙-1-醇鹽酸鹽加以製備。

第 67 號化合物：2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基-1-(甲氧基亞胺基-甲基)-1-甲基-乙基)-1-甲基硫基乙醯胺。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm 8.92(1H,d) ; 8.44(1H,s) ; 8.01(1H,d) ; [{7.68(s br), 7.59(s br)1H} , 異構物 A 和異構物 B] ; [{7.46(s), 7.41(s)1H} , 異構物 A 和異構物 B] ; 7.43(1H,m) ; 7.13(1H,s,br) ; 5.64(1H,s) ; 3.87(s,3H)} ; 3.55-3.87(2H,m) ; [{3.35(s) ; 3.32(s)3H} , 異構物 A 和異構物 B] ; 2.18(s, 3H) ; [{1.56(s), 1.54(s), 3H} , 異構物 A 和

異構物 B]。

以下通式(1)之肟係使用類似於該等敘述於實施例 7、第三階段至第五階段之程序，自 2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-丁酸和 2-胺基-3-甲氧基-2-甲基-丙-1-醇鹽酸鹽加以製備。

第 68 號化合物：2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1-甲氧基甲基-1-甲基-乙基)-丁醯胺。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm 8.88(1H,d)；8.38(1H,d)；7.95(1H,d)；7.22-7.42(3H,m)；6.95(1H,s, br)；4.56(1H,s, br)；[3.76(d), 3.74(d)3H]，異構物 A 和異構物 B]；3.49-3.67(2H,m)；[3.26(s), 3.20(s)3H]，異構物 A 和異構物 B]；1.98-2.07(2H,m)；[1.44(s)；1.42(s)3H]，異構物 A 和異構物 B]；1.06(3H, t)。

實施例 9

本實施例例示根據流程 13(相當於以下第二至第七階段之流程 13 步驟 1 至 6)製備 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(1-(甲氧基亞胺基-甲基)-1-甲基-丙-2-炔基)-2-甲基硫基-乙醯胺(第 69 號化合物)

第一階段：製備 2-胺基-3-(三級-丁基-二苯基-矽烷基氧基)-2-甲基-丙-1-醇

氫化鈉(55%於油中之分散液)(1.141 克)被分批於 0°C 加入 2-胺基-2-甲基-丙-1, 3-二醇(2.50 克)在無水四氫呋喃(35 毫升)中之溶液。反應混合物於室溫之下被攪拌

55'。於 0°C 滴加在無水四氫呋喃(10 毫升)中之三級丁基二苯基甲矽烷基氯化物(6.54 毫克)，所得反應混合物於室溫之下被攪拌 17 小時。反應混合物經水(18 毫升)驟冷，然後，以乙醚萃取三次。分離此二相，有機層經水沖洗，然後，然後經硫酸鈉乾燥。在減壓之下過濾和濃縮，得到 8.94 克粗製之 2-胺基-3-(三級-丁基-二苯基-矽烷基氧基)-2-甲基-丙-1-醇(含少量雜質)，其供下一道步驟使用而不需要另外純化。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 7.68–7.62(4H,m); 7.47–7.37(6H); 3.52 (2H,dd); 3.39(2H,dd); 1.09(9H,s); 1.02(3H,s)。

第二階段:製備 N-[1-(三級丁基-二苯基-矽烷基氧基甲基)-2-羥基-1-甲基-乙基]-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺

室溫之下，對(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸(1.525 克)和三乙胺(2.72 毫升)在無水乙腈(15 毫升)中的溶液，連續加入 1-羥基-7-氮雜苯三唑(0.911 克)和 O-(1H-苯並三唑-1-基)-N,N,N',N'-脲鹽四氫硼酸鹽(2.15 克)在無水乙腈(15 毫升)中的溶液和粗製 2-胺基-3-(三級-丁基-二苯基-矽烷基氧基)-2-甲基-丙-1-醇(2.30 克)在無水乙腈(23 毫升)中的溶液。反應混合物在室溫之下經攪拌 16 小時，然後被倒入飽和碳酸氫鈉、乙酸乙酯和鹽水之混合物中。分離此二相，以乙酸乙酯萃取水層三次。混合有機層，以飽和碳酸氫鈉沖洗(1X)，以鹽水沖洗(1X)，然後經硫酸鈉乾燥。之後，在減壓之下過

濾和濃縮，分離而得到 4.69 克呈暗橙色油之粗製混合物。粗製混合物經快速層析術於矽膠上(庚烷/乙酸乙酯)進行純化，製得 2.07 克 N-[1-(三級丁基-二苯基-矽烷基氧基甲基)-2-羥基-1-甲基-乙基]-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺與來自均偶合方法之(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸 3-(三級丁基-二苯基-矽烷基氧基)-2-[2-(乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯基胺基]-2-甲基-丙酯。

將此殘留物經溶於 40 毫升四氫呋喃/水(1/1)，在室溫之下經 56 毫克 LiOH 單水合物處理 1 小時 20 分鐘。此反應混合物進一步在額外 LiOH 單水合物存在下被攪拌，直到完全消耗掉均偶合產物為止。此粗製混合物經乙酸乙酯萃取(pH=11)三次。合併有機層，以水沖一次，鹽水沖洗一次，然後，於硫酸鈉乾燥。在減壓之下過濾和濃縮之後，製得粗製的呈黃色油之 N-[1-(三級丁基-二苯基-矽烷基氧基甲基)-2-羥基-1-甲基-乙基]-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺(1.94 克)，其供下一道步驟使用而不需要另外純化。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm 8.88(1H,d) ; 8.19 – 8.16(1H,m) ; 8.00(1H,t) ; 7.66 – 7.52(5H,m) ; 7.48 – 7.26(7H,m) ; 7.21 – 7.18(1H,m) ; [$\{5.69(\text{s}), 5.66(\text{s})1\text{H}\}$ ，異構物 A 和異構物 B] ; 4.32 – 4.11(1H,dm) ; 3.78 – 7.52(4H,m) ; 3.30(1H,s) ; [$\{2.21(\text{s}), 2.19(\text{s})3\text{H}\}$ ，異構物 A

和異構物 B]；[{1.49(s)；1.34(s)3H}，異構物 A 和異構物 B]；[{1.11(s)；1.08(s)9H}，異構物 A 和異構物 B]。

第三階段：製備 N-[1-(三級丁基-二苯基-矽烷基氧基甲基)-1-甲基-2-氧代-乙基]-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺

來自上述第二階段之 N-[1-(三級丁基-二苯基-矽烷基氧基甲基)-2-羥基-1-甲基-乙基]-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺(1.90 克)在二氯甲烷(55 毫升)中經 Dess-Martin 高碘烷(1.615 克)處理。反應混合物在室溫之下經攪拌 1 小時 30 分鐘，然後，反應混合物經飽和水性碳酸氫鈉和飽和水性硫代硫酸鈉驟冷。反應混合物在室溫之下經激烈攪拌 50 分鐘，之後，分離此二相，有機層經飽和水性碳酸氫鈉沖洗三次，分離有機相之後，以硫酸鈉乾燥，經過濾和蒸發，製得 1.694 克粗製產物 N-[1-(三級丁基-二苯基-矽烷基氧基甲基)-1-甲基-2-氧代-乙基]-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺(伴隨著少量雜質)。此粗製混合物供下一道步驟使用而不需要另外純化。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm[{9.51(s)，9.49(s)1H}，異構物 A 和異構物 B]；8.88(1H,d)；8.19(1H，d)；8.02(1H，d)；7.66—7.54(5H，m)；7.48—7.30(7H，m)；7.26—7.21(1H，dd)；[{5.70(s)，5.66(s)1H}，異構物 A 和異構物 B]；4.01—3.88(2H,m)；3.30(1H,s)；[{2.22(s)，2.20(s) 3H}，異構物 A 和異構物 B]；[{1.50(s)，1.48(s) 3H}，異構物 A 和異構物 B]。

構物 B]；[{1.02(s)，0.99(s)9H)，異構物 A 和異構物 B]。

第四階段:製備 N-[1-(三級丁基-二苯基-矽烷基氧基甲基)-1-甲基-丙-2-炔基]-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺

於室溫之下將二甲基-1-重氮-2-氧代丙基膦酸酯(0.86 克)在無水甲醇(20 毫升)之溶液加入粗製 N-[1-(三級丁基-二苯基-矽烷基氧基甲基)-1-甲基-2-氧代-乙基]-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺在無水甲醇(40 毫升)中之溶液中。反應媒介經冷卻至 0°C，分批加入碳酸鉀(0.773 克)並伴隨著無水甲醇(10 毫升)。反應混合物經回溫至室溫，另外攪拌 16 小時，然後倒入乙酸乙酯和鹽水之混合物。分離此二相，水層經乙酸乙酯萃取三次。合併有機層，以鹽水沖洗一次，然後經硫酸鈉乾燥。在減壓之下經過濾和蒸發之後，分離為暗黑色油之粗製混合物，此殘留物經管快速層析術於矽膠上(庚烷/乙酸乙酯)進行純化，製得 1.523 克呈黃色油之黃色油之 N-[1-(三級丁基-二苯基-矽烷基氧基甲基)-1-甲基-丙-2-炔基]-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm 8.88(1H,d)；8.19(1H,d)；8.01(1H,dd)；7.70—7.62(4H,m)；7.46—7.30(8H,m)；7.21—7.19(1H,m)；[{5.69(s)，5.66(s)1H}]，異構物 A 和異構物 B]；3.93—3.72(2H,dm)；3.30(1H,s)；2.39(1H,d)；[{2.23(s)，2.21(s)3H}]，異構物 A 和異構物 B]；1.71(3H,d)；[{1.10(s)；

1.08(s)9H}，異構物 A 和異構物 B]。

第五階段: 製備 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-[1-羥基甲基-1-甲基丙-2-炔基]-2-甲基硫基-乙醯胺

將四丁基銨氟化物(1M)於四氫呋喃中之溶液於 0℃ 滴加入 N-[1-(三級丁基-二苯基-矽烷基氧基甲基)-1-甲基-丙-2-炔基]-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺(1.49 克)之溶液中。使反應混合物經回溫至室溫，另外攪拌 1 小時 20 分鐘，然後倒入乙酸乙酯和鹽水之混合物。分離此二相，水層經乙酸乙酯萃取三次。合併有機層，以鹽水沖洗一次，然後經硫酸鈉乾燥。在減壓之下經過濾和蒸發之後，分離為 2.47 克呈黃油之粗製混合物，此殘留物經管快速層析術於矽膠上(庚烷/乙酸乙酯)進行純化，製得 0.646 克為白色固體之 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-[1-羥基甲基-1-甲基丙-2-炔基]-2-甲基硫基-乙醯胺(熔點為 150 至 150℃)。

第六階段: 製備 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-[1-甲醯基-1-甲基-丙-2-炔基]-2-甲基硫基-乙醯胺

2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-[1-羥基甲基-1-甲基丙-2-炔基]-2-甲基硫基-乙醯胺(0.513 克)在二氯甲烷(25 毫升)中經 Dess-Martin 高碘烷(0.737 克)處理。反應混合物在室溫之下經攪拌 2 小時，然後，反應混合物經水性飽和碳酸氫鈉和飽和水性硫代硫酸鈉驟冷。

反應混合物在室溫之下經激烈攪拌 40 分鐘，之後，分離此二相，有機相經硫酸鈉乾燥，過濾和蒸發，製得 0.523 克粗製產物之 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-[1-甲醯基-1-甲基-丙-2-炔基]-2-甲基硫基-乙醯胺(伴隨著少量雜質)，其供下一道步驟使用而不需要另外純化。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm 9.40(1H, s); 8.86(1H, d); 8.22(1H, d); 8.07(1H, d); 7.52–7.49(1H, m); [$\{7.49(\text{s br})$, 7.44(s br)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; 7.26(1H, m); [$\{5.74(\text{s})$, 5.72(s)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; 3.29(1H, 1s); 2.54(1H, s); [$\{2.23(\text{s})$; 2.21(s)3H}, 異構物 A 和異構物 B]; 1.79(3H, s)。

第七階段: 製備 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(1-(甲氧基亞胺基-甲基)-1-甲基-丙-2-炔基)-2-甲基硫基-乙醯胺

得自於上述第六階段所述之粗製 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-[1-甲醯基-1-甲基-丙-2-炔基]-2-甲基硫基-乙醯胺(0.125 克)，吡啶(0.034 毫升)和 O-1-甲基-羥基胺鹽酸鹽(0.036 克)於無水甲醇(6 毫升)中於室溫之下攪拌 6 小時。反應混合物經乙酸乙酯稀釋，倒入飽和碳酸氫鈉。分離此二相，以乙酸乙酯萃取水層三次。混合的有機層經硫酸鈉乾燥，過濾和蒸發。殘留物經與甲苯共同蒸發，然後，經快速層析術(庚烷/乙酸乙酯為 4:3 至 1:1)純化，製得 0.106 克呈無色油之 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(1-(甲氧基亞胺基-甲基)-1-

甲基-丙-2-炔基)-2-甲基硫基-乙醯胺。

(第 69 號化合物) ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm 8.84(1H,d); 8.22(1H,d); 8.06(1H,d); [$\{7.88(\text{s br}), 7.80(\text{s br})1\text{H}\}$, 異構物 A 和異構物 B]; 7.50(1H,s); 7.45(1H,dd); 7.21 – 7.24(1H,m); [$\{5.72(\text{s}), 5.70(\text{s})1\text{H}\}$, 異構物 A 和異構物 B]; [$\{3.95(\text{s}); 3.92(\text{s})3\text{H}\}$, 異構物 A 和異構物 B]; 3.29(1H,s); 2.54(1H,d); 2.21(3H,s); [$\{1.90(\text{s}); 1.87(\text{s})3\text{H}\}$, 異構物 A 和異構物 B]。

實施例 10

實施例 10 提供部分列於以上所引述表的化合物的 NMR 數據及/或熔點且已使用類似實施例 1 至 9 所述程序，除非特別特定。除非特別特定，所記載之 ^1H NMR 訊號為主要非對映異構物之特徵。

因此，以下通式(1)之喹啉-6-基氧基-甲氧基-乙酸肟係使用類似於該等於實施例 1 及/或 3 所述關於相對應喹啉-6-基氧基-甲基硫基-乙酸衍生物之程序加以製備。

第 70 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-2-甲氧基-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.80 (1H,d); 8.22 (1H,d); 8.02 (1H,d); 7.51(1H,dd); 7.48(1H,s br); 7.40(1H,s); 7.38(1H,d); 5.43(1H,s); 3.88(3H,s); 3.52(3H,s); 1.57(3H,s); 1.54(3H,s)。

第 71 號化合物：2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲氧基-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-

乙基)-乙醯胺：熔點為 130 至 132°C。

第 72 號化合物：2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-2-甲氧基-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-乙醯胺：熔點為 101 至 103°C。

第 73 號化合物：2-(3-碘-6-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲氧基-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-乙醯胺：熔點為 126 至 128°C。

第 74 號化合物：2-甲氧基-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-三甲基矽烷乙炔基-喹啉-6-基氧基)乙醯胺：

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.81 (1H,d); 8.18 (1H,d); 8.03 (1H,d); 7.49–7.51(2H,m); 7.40(1H,s); 7.38–7.41(1H,m); 5.43(1H,s); 3.88(3H,s); 3.52(3H,s); 1.52(3H,s); 1.42(3H,s); 0.30(9H,s)。

第 75 號化合物：2-甲氧基-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(8-甲基-3-三甲基矽烷乙炔基-喹啉-6-基氧基)乙醯胺：

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.81 (1H,d); 8.12 (1H,d); 7.48 (1H,s br); 7.40(1H,s); 7.34–7.37(1H,m); 7.21(1H,d); 5.43(1H,s); 3.88(3H,s); 3.52(3H,s); 2.57(3H,s); 1.57(3H,s); 1.52(3H,s); 0.30(9H,s)。

第 76 號化合物：2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲氧基-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82 (1H,d); 8.18 (1H,d); 8.03 (1H,d); 7.51 – 7.53 (2H,m); 7.42 (1H,s); 7.40 (1H,s); 5.43 (1H,s); 3.88 (3H,s); 3.52 (3H,s); 3.28 (1H,s); 1.57 (3H,s); 1.52 (3H,s)。

第 77 號化合物: 2-(3-乙炔基-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲氧基-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-乙醯胺: 熔點為 138 至 140°C。

實施例 11

此實施例係例示製備 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(1-(甲氧基亞胺基-甲基)-環丁基)-2-甲基硫基-乙醯胺(第 78 號化合物):

第一階段: 製備 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(1-羥基甲基-環丁基)-2-甲基硫基-乙醯胺

在氮氣大氣及在室溫之下，對(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-甲基硫基-乙酸(1.10 克)在 CH_3CN (40 毫升)中之溶液加入 Et_3N (2.25 毫升)， AHOBt (0.06 克)， TBTU (1.50 克)和(1-胺基-環丁基)-甲醇(0.06 克)。在相同溫度之下攪拌此混合物 1 小時，然後倒入飽和水性 NH_4Cl ，以乙酸乙酯(2x20 毫升)萃取。分離有機相，以飽和 $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$ 和飽和水性氯化鈉沖洗，然後於無水硫酸鈉乾燥，在真空之下過濾及蒸發。經快速層析術(己烷/乙酸乙酯，2/1)純化而製得呈黃色油之 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(1-羥基甲基-環丁基)-2-甲基硫基-乙醯胺(0.70 克)。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.80 (1H,d); 8.15 (1H,d); 8.00

(1H,d) ; 7.41(1H,dd) ; 7.18(1H,d) ; 7.04(1H,s broad) ; 5.63(1H,s) ; 3.83(2H,s) ; 3.28(1H,s) ; 2.27 – 2.21(2H,m) ; 2.18(2H,m) ; 1.99 – 1.79(2H,m)。

第二階段：製備 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(1-甲醯基-環丁基)-2-甲基硫基-乙醯胺

在氮氣大氣及在室溫之下，將 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(1-羥基甲基-環丁基)-2-甲基硫基-乙醯胺(310 毫克)在二氯甲烷(30 毫升)中的溶液加入固體 Dess-Martin 高碘烷(480 毫克)。混合物在相同溫度之下攪拌 1 小時。反應混合物被倒入飽和水性碳酸氫鈉以及以二氯甲烷萃取(2x15 毫升)。分離有機相，以水性 $\text{Na}_2\text{S}_2\text{O}_3$ 和飽和水性氯化鈉沖洗，然後於無水硫酸鈉乾燥，在真空之下過濾及蒸發。粗製化合物(250 毫克)為黃色油，其供下一道步驟使用而不需要另外純化。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 9.69 (1H,s); 8.84 (1H,d); 8.20 (1H,d) ; 8.05 (1H,d) ; 7.47(1H,dd) ; 7.42(1H,s broad) ; 7.26(1H,d); 5.72(1H,s); 3.29(1H,s); 2.73 – 2.64(2H,m); 2.57 – 2.49(2H,m) ; 2.20(3H,s) ; 2.16 – 1.97(2H,m)。

第三階段：製備 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(1-(甲氧基亞胺基-甲基)-環丁基)-2-甲基硫基-乙醯胺

在室溫之下對 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(1-甲醯基-環丁基)-2-甲基硫基-乙醯胺(125 毫克)在乙醇(10 毫升)中之溶液加入乙酸鈉(50 毫克)和 O-甲基

經基胺鹽酸鹽(44 毫克)。於 1 小時內將混合物加熱至 65°C。在冷卻至室溫之後，將混合物倒入水中，以乙酸乙酯萃取(2x10 毫升)。有機相經飽和氯化鈉水溶液沖洗，於無水硫酸鈉乾燥，在真空之下過濾和蒸發。經快速層析術(乙酸乙酯/環己烷為 1:1)純化，製得呈黃色油之 2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(1-(甲氧基亞胺基-甲基)-環丁基)-2-甲基硫基-乙醯胺。

第 78 號化合物： ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.84 (1H,d); 8.20 (1H,d); 8.05 (1H,d); 7.70(1H,s); 7.45(1H,dd); 7.34(1H,s broad); 7.22(1H,d), 5.66(1H,s); 3.85(3H,s); 3.28(1H,s); 2.79 – 2.71(2H,m); 2.45 – 2.35(2H,m); 2.20(3H,s); 2.06 – 1.86(2H,m)。

以下通式(1)之 N-(1-甲醯基-環丁基)-2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺衍生之肟係使用類似於該等於實施例 11、第三階段之程序，自相對應經取代之喹啉基乙醯胺加以製備。

第 79 號化合物：2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-N-(1-(甲氧基亞胺基-甲基)-環丁基)-2-甲氧基乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.92 (1H,d); 8.45 (1H,d); 8.00 (1H,d); 7.69(1H,s); 7.43(1H,dd); 7.35(1H,s broad); 7.14(1H,d); 5.65(1H,s); 3.84(3H,s); 2.78 – 2.70(2H,m); 2.44 – 2.35(2H,m); 2.19(3H,s); 2.05 – 1.80(2H,m)。熔點為 140 至 149°C。

第 80 號化合物：2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)

—N—(1—(甲氧基亞胺基—甲基)—環丁基)—2—甲氧基乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 9.73(1H,s broad) ; 8.79 (1H,d) ; 8.17 (1H,d) ; 7.99 (1H,d) ; 7.80(1H,s) ; 7.53(1H,s broad) ; 7.33(1H,dd) ; 7.18(1H,d) ; 5.65(1H,s) ; 3.28(1H,s) ; 2.93 — 2.81(2H,m) ; 2.44 — 2.30(2H,m); 2.15(3H,s) ; 2.10 — 1.83(2H,m)。熔點為 165 至 166°C。

實施例 12

此實施例係例示製備 2—(4—氯—苯並[b]噻吩—6—基氧基)—N—(2—甲氧基亞胺基—1,1—二甲基乙基)—2—甲基硫基—乙醯胺(第 81 號化合物):

第一階段：製備 4—氯—苯並[b]噻吩—6—醇

步驟 1：二甲基—硫胺甲酸 O—(3—氯—5—甲氧基—苯基)酯(10.4 克, 0.042 毫莫耳)被懸浮於氫氧化鉀(11.8 克, 0.21 莫耳)(於 80 毫升 EtOH/水(3:1)中), 反應混合物被加熱至回流 2 小時。反應經冷卻, 被濃縮至約 50 毫升, 以乙酸乙酯稀釋, 混合物被倒入冰冷鹽酸中。然後分離有機層, 以水、鹽水沖洗, 在真空中乾燥和濃縮, 製得 8 克 3—氯—5—甲氧基—苯硫醇, MS m/z 174(M^+), 供如步驟 2 使用。

步驟 2：在攪拌之下將 3—氯—5—甲氧基—苯硫醇(8 克, 0.045 莫耳)溶於乙氧化鈉於乙醇中之溶液(由 2 克鈉和 50 毫升無水乙醇加以製備)。然後, 加入溴乙醛二乙基乙縮醛(9 克, 0.045 莫耳), 此混合物經回流 2 小時。大部分乙醇經移除, 以水稀釋殘留物, 以乙酸乙酯萃取之。以水、

鹽水沖洗有機層，在真空下乾燥及濃縮，製得 10 克之 MS m/z 290(M^+)，其如此供步驟 3 使用。

步驟 3：來自步驟 5 之 1-氯-3-(2,2-二乙氧基-乙基硫基)-5-甲氧基-苯(5 克，0.017 莫耳)於二氯甲烷(100 毫升)中之溶液，於氮氣及在室溫下被滴加入 $BF_3 \cdot Et_2O$ (2.2 毫升，0.017 莫耳)在無水二氯甲烷(200 毫升)中之溶液。然後，此反應在室溫之下被攪拌 2 小時，以碳酸氫鈉水溶液使其驟冷。分離有機層，以二氯甲烷萃取水層。經合併的有機萃取物經水、鹽水沖洗，經乾燥及濃縮。殘留物經快速層析術(矽膠：己烷)純化，製得 4-氯-6-甲氧基苯並[b]噻吩，MS m/z 198 (M^+)。

步驟 4：來自步驟 3 之 4-氯-6-甲氧基苯並[b]噻吩(2.7 克，0.013 莫耳)之去保護係使用 BBr_3 予以進行。在 $-78^\circ C$ 之下攪拌反應混合物 1 小時、然後在室溫之下隔夜之後，將溶液冷卻至 $0^\circ C$ ，以添加水予以驟冷。分離二氯甲烷層，於二氯甲烷中萃水層。經合併的萃取物經水、碳酸氫鈉、鹽水沖洗，於無水硫酸鈉乾燥，且在真空中除去溶劑之後，所得到的 4-氯-苯並[b]噻吩-6-醇產物經管柱純化(矽膠，己烷：乙酸乙酯為 10：1)。

^1H NMR ($CDCl_3$) δ ppm: 7.35(1H,dd); 7.26 (1H,d); 7.21 (1H,dd); 6.70(1H,d); MS m/z 184 (M^+)。

第二階段：製備 2-(4-氯-苯並[b]噻吩-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

依類似於實施例 1、第一階段(步驟 1 至 2)和第二階段(步驟 1)之方式自 4-氯-苯並[b]噻吩-6-醇製備 2-(4-氯-苯並[b]噻吩-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺，其中使用來自實施例 2 步驟 4 之 2-胺基-2-甲基-丙醛 O-甲基-肟取代實施例 1 第二階段步驟 1 之 2-胺基-2-甲基-1-丙醇。

第 81 號化合物: 2-(4-氯-苯並[b]噻吩-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 7.54(1H, s br); 7.41 (4H, s br); 7.14 (1H, d); 5.52(1H, s); 3.88(3H, s); 2.18 (3H, s); 1.59 (3H, s); 1.57(3H, s); 熔點 120 至 122°C。

實施例 13

此實施例係例示製備 N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-3-(4-甲基-苯並[b]噻吩-6-基)-2-甲基硫基-丙醯胺(第 82 號化合物):

第一階段: 製備 4-甲基-苯並[b]噻吩-6-醇

步驟 1: 在惰性大氣之下，對 3-溴-5-甲氧基甲苯(7 克，0.035 莫耳)在無水四氫呋喃(80 毫升)中的冷卻(-78°C)溶液滴加丁基鋰溶液(在己烷中之 1.6M 溶液; 32.8 毫升，0.05 莫耳)，此混合物在相同溫度之下經攪拌 1 小時。然後滴加二甲基二硫化物(4.6 毫升，0.05 莫耳)，使反應混合物保持在室溫之下達 2 小時，在室溫之下攪拌隔夜。以氯化

鉍使反應混合物驟冷，以二乙醚予以萃取。經合併的有機萃取物經水和鹽水沖洗，並予以乾燥。在真空之下使溶劑蒸發，得到 6.5 克產物，1-異丁基硫基-3-甲氧基-5-甲基-苯 MS m/z 168 (M^+)。

步驟 2：在氮氣之下及在 100°C 之下，3-甲基-5-甲氧基茴香硫醚(6.5 克，0.04 莫耳)在 HMPA(100 毫升)中之溶液在攪拌被加入小片鈉(2.29 克，0.09 毫莫耳)，此混合物進一步在 100°C 被攪拌 3 小時。使此反應團回至室溫，然後將溴乙醛二乙基乙縮醛(7 毫升，0.04 莫耳)加入此混合物，且在室溫之下攪拌隔夜。反應混合物經甲醇驟冷，被倒入冰水中，於乙酸乙酯中萃取。經合併的有機萃取物經水、鹽水沖洗，予以乾燥。在真空之下蒸發溶劑，製得 7 克產物(m/z 270(M^+))，其如此供以下步驟 3 使用。

步驟 3：來自步驟 2 產物(3 克，0.01 莫耳)在二氯甲烷(25 毫升)中之溶液，在室溫及氮氣之下被滴加入 $\text{BF}_3 \cdot \text{Et}_2\text{O}$ (1.2 毫升，0.01 莫耳)在無水二氯甲烷(220 毫升)中之溶液在氮氣之下及在 100°C 之下，3-甲基-5-甲氧基。然後，此反應在室溫之下經攪拌 3 小時，以碳酸氫鈉水溶液使其驟冷。分離有機層，水層經二氯甲烷萃取。經合併的有機萃取物經水、鹽水沖洗，經乾燥和濃縮。殘留物經快速層析術(矽膠：己烷)純化，製得 6-甲氧基-4-甲基苯並[b]噻吩，0.55 克，MS m/z 178(M^+)。

步驟 4：來自步驟 3 之 6-甲氧基-4-甲基苯並[b]噻吩物(0.550 克，3 毫莫耳)和吡啶鹽酸鹽(5 克，40 毫莫耳)

在氮氣大氣之下及在 200°C 之下被加熱達 3 小時。反應混合物被冷卻，然後予以冷卻，經水稀釋，在乙酸乙酯中進行萃取。經合併的有機萃取物經 2N 鹽酸和鹽水沖洗，予以乾燥。在真空之下蒸發溶劑，得到 0.5 克的 4-甲基-苯並[b]噻吩-6-醇，其供下一第二階段使用。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 7.28(1H,dd); 7.24 (1H,d); 7.15 (1H,d); 6.73(1H,s br); 2.56(3H,s); MS m/z 164(M^+)。

第二階段：製備 N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-3-(4-甲基-苯並[b]噻吩-6-基)-2-甲基硫基-丙醯胺

依類似於實施例 1、第一階段(步驟 1 至 2)和第二階段(步驟 1)之方式自 4-甲基-苯並[b]噻吩-6-醇製備 N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-3-(4-甲基-苯並[b]噻吩-6-基)-2-甲基硫基-丙醯胺，其中使用來自實施例 2 步驟 4 之 2-胺基-2-甲基-丙醛 O-甲基-肟取代實施例 1 第二階段步驟 1 之 2-胺基-2-甲基-1-丙醇。

第 82 號化合物：N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(4-甲基-苯並[b]噻吩-6-基)-2-甲基硫基-丙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.10(1H,s br); 7.61 (1H,d); 7.52(1H,s); 7.44(1H,d); 7.42(1H,d); 5.80(1H,s); 3.72 (3H,s); 2.54(3H,s); 2.12(3H,s); 1.41(3H,s); 1.40(3H,s)。

實施例 14

此實施例係例示製備 2-(7-氯-苯並[b]噻吩-5-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(第 83 號化合物):

第一階段: 製備 7-氯-苯並[b]噻吩-5-醇:

步驟 1: 對 2,3-二氯-5-硝基苯甲醛(10 克, 0.045 莫耳)和巰基乙酸甲酯(6.6 毫升, 0.06 莫耳)在二甲基甲醯胺(200 毫升)中之溶液加入在 50 毫升水中之氫氧化鉀(6 克)。在攪拌 2 小時之後, 反應混合物被倒入冰水中, 混合物於乙酸乙酯中經萃取。有機層經水沖洗, 且予以乾燥。蒸發溶劑後而得到粗製產物, 其經己烷重覆沖洗而純化得到 12.3 克之 7-氯-5-硝基-苯並[b]噻吩-2-羧酸甲酯。

步驟 2: 對來自步驟 2 之酯(10.5 克, 0.038 莫耳)在甲醇(30 毫升)中之溶液加入氫氧化鈉水溶液(2.6 克於 10 毫升水中), 反應混合物經回流 4 小時。移除大部分甲醇, 混合物經水(25 毫升)稀釋, 以醚沖洗。然後, 水層經稀鹽酸酸化, 製得之固體經過濾且經冷水沖洗且乾燥, 製得 8.7 克之 7-氯-5-硝基-苯並[b]噻吩-2-羧酸。

步驟 3: 對來自步驟 2 之酸(12.9 克, 0.05 莫耳)在喹啉(200 毫升)中之懸浮液加入銅粉(5.2 克, 0.08 莫耳), 此混合物於 200°C 被加熱 2 小時。反應混合物經冷卻且於醚中萃取。含醚層經 50%鹽酸、鹽水沖洗, 且於硫酸鈉乾燥, 經濃縮而得到 6.2 克 7-氯-5-硝基-苯並[b]噻吩, 其供步驟 4 使用, MS m/z 213 (M^+)。

步驟 4: 步驟 4 中所得到的 7-氯-5-硝基-苯並[b]

噻吩(4.4 克, 20 毫莫耳)在 5% 乙酸(300 毫升)和 乙酸乙酯(300 毫升)中的溶液在回流之下被分批加入鐵粉(6 克, 100 毫莫耳), 此混合物經回流 4 小時。反應混合物經冷卻, 經 celite 過濾, 以 乙酸乙酯予以沖洗。分離各層, 水層於 乙酸乙酯中萃取。經合併之有機萃取物被水沖洗, 經乾燥及濃縮。殘留物經管柱層析術(矽膠, 己烷: 乙酸乙酯為 4: 1)純化而製得 2 克之 7-氯-苯並[b]噻吩-5-基胺。MS m/z 183 (M^+)。

步驟 5: 7-氯-苯並[b]噻吩-5-基胺(2.3 克, 0.012 莫耳)在稀硫酸(14 毫升濃硫酸在 400 毫升水中)中之懸浮液被加熱而得到澄清溶液, 且其經冷卻至 0°C。滴加 NaNO_2 (0.9 克於 5 毫升水中, 0.013 莫耳)之冰溶液, 此混合物於相同溫度之經攪拌 1 小時, 然後於 30 分鐘回溫至 10°C。然後以脲使過量之脲驟冷。然後, 將此反應混合物加至經稀釋且維持在 90°C 之硫酸(8 毫升濃硫酸於 115 毫升水中), 此混合物進一步被回流 1 小時。反應混合物經熱過濾, 濾液在室溫之下經攪拌隔夜。混合物經 乙酸乙酯萃取, 經合併的有機萃取物經水、鹽水沖洗, 經乾燥且濃縮。殘留物經管柱層析術(矽膠, 己烷: 乙酸乙酯為 9: 1)純化而製得 0.4 克之 7-氯-苯並[b]噻吩-5-醇。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 7.49(1H,d); 7.23 (1H,d); 7.16 (1H,d); 6.97(1H,d); MS m/z 184(M^+)。

第二階段: 製備 2-(7-氯-苯並[b]噻吩-5-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫

基-乙醯胺

依類似於實施例 1、第一階段(步驟 1 至 2)和第二階段(步驟 1)之方式自 7-氯-苯並[b]噻吩-5-醇製備 2-(7-氯-苯並[b]噻吩-5-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺，其中使用來自實施例 2 步驟 4 之 2-胺基-2-甲基-丙醛 O-甲基-肟取代實施例 1 第二階段步驟 1 之 2-胺基-2-甲基-1-丙醇。

第 83 號化合物: 2-(7-氯-苯並[b]噻吩-5-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基乙醯胺

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 7.56(1H, s br); 7.54(1H, d); 7.41(1H, s); 7.33(1H, d); 7.32(1H, d); 7.14(1H, d); 5.54(1H, s); 3.87(3H, s); 2.18(3H, s); 1.59(3H, s); 1.57(3H, s)。

實施例 15

此實施例係例示製備 N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-(7-甲基-苯並[b]噻吩-5-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺(第 84 號化合物):

第一階段: 製備 7-甲基-苯並[b]噻吩-5-醇

步驟 1: 在惰性大氣之下，對 2-溴-5-甲氧基甲苯(8 克，0.04 莫耳)在無水四氫呋喃(80 毫升)中的冷卻(-78°C)溶液滴加丁基鋰溶液(在己烷中之 1.6M 溶液; 36.8 毫升，0.058 莫耳)，此混合物在相同溫度之下經攪拌 1 小時。然後滴加二甲基二硫化物(7.7 毫升，0.08 莫耳)，使反應混合物

回溫至室溫之下達 2 小時。以飽和氯化銨使反應混合物驟冷，以二乙醚予以萃取。經合併的有機萃取物經水和鹽水沖洗，並予以乾燥。在真空之下使溶劑蒸發，得到 6.5 克產物，2-甲基-4-甲氧基茴香硫醚，其供步驟 2 使用，MS m/z 168 (M^+)。

步驟 2：在氮氣之下及在 100°C 之下，2-甲基-4-甲氧基茴香硫醚(8.0 克，0.04 莫耳)在 HMPA(130 毫升)中之溶液在攪拌被加入小片鈉(2.9 克，0.12 毫莫耳)，此混合物進一步在 100°C 被攪拌 4 小時。使此反應團回至室溫，然後將溴乙醛二乙基乙縮醛(8 毫升，0.05 莫耳)加入此混合物，且在室溫之下攪拌 2 小時。反應混合物經甲醇驟冷，被倒入冰水中，於醚中萃取。經合併的有機萃取物經水、鹽水沖洗，予以乾燥。在真空之下蒸發溶劑，製得 8.5 克 1-(2,2-二乙氧基-乙基硫基)-4-甲氧基-2-甲基苯(m/z 270(M^+))。

步驟 3：對聚磷酸(20 毫升)在氯苯(50 毫升)中之熱溶液(130°C)，於 2 小時期間滴加來自步驟 2 之 1-(2,2-二乙氧基-乙基硫基)-4-甲氧基-2-甲基苯(6.8 克，0.025 莫耳)在二氯甲烷(25 毫升)中之溶液，在相同溫度之下攪拌 2 小時。將反應混合物冷卻至室溫，攪拌 12 小時。然後冷卻混合物，以水稀釋，分離各層。水層經乙酸乙酯萃取。經合併的有機層經水沖洗，經乾燥和濃縮。粗製物質經層析術(矽膠：己烷：乙酸乙酯 4：1)純化，製得 2 克 7-甲基-5-甲氧基苯並[b]噻吩，MS m/z 178(M^+)。

步驟 4：對來自步驟 3 之 7-甲基-5-甲氧基苯並[b]噻吩(2 克，11 毫莫耳)於無水二氯甲烷(60 毫升)中之溶液，於 -78°C 及在 20 分鐘加入三溴化硼(1.3 毫升於 10 毫升二氯甲烷，13 毫莫耳)。反應混合物在 -78°C 被攪拌 1 小時，然後在室溫之下被攪拌 4 小時。溶液被冷卻至 0°C ，小心添加水予以驟冷。分離二氯甲烷層，水層於二氯甲烷中進行萃取。經合併的萃取物經水、碳酸氫鈉、鹽水沖洗，於無水硫酸鈉乾燥，且濃縮。殘留物經管柱層析術(矽膠：己烷：乙酸乙酯 4：1)純化，製得 1.4 克產物，7-甲基-5-羥基苯並[b]噻吩，其供下一道步驟(第二階段)使用。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 7.42(1H,dd); 7.23 (1H,d); 7.10 (1H,d); 6.75(1H,d); 2.52(3H,s); MS m/z 164(M^+)。

第二階段：製備 N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-(7-甲基-苯並[b]噻吩-5-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺

依類似於實施例 1、第一階段(步驟 1 至 2)和第二階段(步驟 1)之方式自 7-甲基-5-羥基苯並[b]噻吩-6-醇製備 N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基乙基)-2-(7-甲基-苯並[b]噻吩-5-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺，其中使用來自實施例 2 步驟 4 之 2-胺基-2-甲基-丙醛 O-甲基-肟取代實施例 1 第二階段步驟 1 之 2-胺基-2-甲基-1-丙醇。

第 84 號化合物：N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(7-甲基-苯並[b]噻吩-6-基氧基)-2-甲

基 硫 基 丙 醯 胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.10(1H,s br) ; 7.61 (1H,d) ; 7.52(1H,s) ; 7.44(1H,d) ; 7.42(1H,d) ; 5.80(1H,s) ; 3.72 (3H,s) ; 2.54(3H,s) ; 2.12(3H,s) ; 1.41(3H,s) ; 1.40(3H,s)。

實 施 例 16

此實施例係例示製備 2-(7-溴-4-基-萘-2-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(第 85 號化合物)：

第一階段：製備 7-溴-4-甲基-萘-2-醇

步驟 1：對 7-甲氧基-5-甲基-3,4-二氫-2H-萘-1-酮(8.3 克，0.04 莫耳)在甲醇(20 毫升)中的冷卻(-10 °C)溶液滴加溴 (2.3 毫升，0.04 莫耳)在甲醇(10 毫升)中之溶液，此混合物經攪拌 2 小時，同時使溫度回升至室溫。在真空之下除去甲醇，以乙酸乙酯稀釋混合物，以硫酸硫酸鈉水溶液、鹽水沖洗，予以乾燥。使溶劑蒸發，得到 10 克灰白色固體之 2-溴-7-甲氧基-5-甲基-3,4-二氫-2H-萘-1-酮，其供步驟 2 使用，MS m/z 271 (M^+)。

步驟 2：對在步驟 1 中所得到的 2-溴-7-甲氧基-5-甲基-3,4-二氫-2H-萘-1-酮(10 克，0.04 莫耳)在甲醇(100 毫升)中之冰冷溶液加入硼氫化鈉(2.0 克，0.05 毫莫耳)，此混合物在室溫之下被攪拌 2 小時。使此反應混合物冷卻，以丙酮予以驟冷，且經濃縮。混合物經水稀釋，於二乙醚中萃取。有機層經鹽水沖洗，予以乾燥，經濃縮而製得 8.0 克 2-溴-7-甲氧基-5-甲基-1,2,3,4-四氫

— 萘 — 1 — 醇，其供步驟 3 使用。

步驟 3：對步驟 3 中所得到的萘 — 1 — 醇(8.0 克，0.03 莫耳)在甲苯(30 毫升)中的溶液在回流之下被加入 PTSA(400 毫克)，此混合物在回流下被攪拌 4 小時。蒸發甲苯，混合物經水稀釋，於二乙醚中萃取。有機層經碳酸氫鈉、鹽水沖洗，經乾燥及蒸發。粗製物質經層析術(矽膠：己烷：乙酸乙酯 10：1)純化，製得 8.0 克 3 — 溴 — 6 — 甲氧基 — 8 — 甲基 — 1,2 — 二氫 — 萘，其供步驟 4 使用。

步驟 4：對來自步驟 3 之 3 — 溴 — 6 — 甲氧基 — 8 — 甲基 — 1,2 — 二氫 — 萘(8 克，0.03 莫耳)於 1,4 — 二噁烷(40 毫升)中之溶液，加入 DDQ(7.9 克，0.03 莫耳)，混合物經回流 2 小時。除去溶劑，粗製產物經層析術(矽膠：己烷：乙酸乙酯 20：1)純化，製得 3.7 克 6 — 溴 — 3 — 甲氧基 — 1 — 甲基 — 萘。

步驟 5：對來自步驟 4 之 6 — 溴 — 3 — 甲氧基 — 1 — 甲基 — 萘(3.7 克，0.015 莫耳)於 38% HBr — 乙酸(20 毫升)中之懸浮液經回流 16 小時。然後，混合物於乙酸乙酯中萃取，萃取物經 10% 氫氧化鈉溶液鹼化，分離各層。水層經稀鹽酸化，以乙酸乙酯萃取之。有機層經鹽水沖洗，乾燥，經濃縮而製得 1.9 克 7 — 溴 — 4 — 甲基 — 萘 — 2 — 醇，其供下一道步驟使用。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 7.8(1H,d) ; 7.75(1H,d) ; 7.41(1H,dd) ; 6.95(1H,s) ; 6.90(1H,s) ; 2.63(3H,s) ; MS m/z 238 ($M+2$)。

第二階段：製備 2-(7-溴-4-基-萘-2-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

依類似於實施例 1、第一階段(步驟 1 至 2)和第二階段(步驟 1)之方式自 7-溴-4-甲基-萘-2-醇製備 2-(7-溴-4-基-萘-2-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺，其中使用來自實施例 2 步驟 4 之 2-胺基-2-甲基-丙醛 O-甲基-肟取代實施例 1 第二階段步驟 1 之 2-胺基-2-甲基-1-丙醇。

第 85 號化合物：2-(7-溴-4-基-萘-2-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 7.91(1H,s) ; 7.78(1H,d) ; 7.56(1H,s br) ; 7.53(1H,d) ; 7.49(1H,d) ; 7.41(1H,s) ; 7.08(1H,s) ; 7.06(1H,s) ; 5.62(1H,s) ; 3.87(3H,s) ; 2.65(1H,s) ; 2.18(3H,s) ; 1.59(3H,s) ; 1.56(3H,s) ; 熔點為 104 至 107°C。

實施例 17

此實施例係例示製備 2-(苯並噻唑-5-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(第 86 號化合物)：

步驟 1：依類似於實施例 1、第一階段(步驟 1 至 2)和第二階段(步驟 1)之方式自苯並噻唑-5-醇製備 2-(苯並噻唑-5-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基

—乙基)—2—甲基硫基—乙醯胺，其中使用來自實施例 2 步驟 4 之 2—胺基—2—甲基—丙醛 O—甲基—肟取代實施例 1 第二階段步驟 1 之 2—胺基—2—甲基—1—丙醇。

第 86 號化合物：2—(7—溴—4—基—萘—2—基氧基)—N—(2—甲氧基亞胺基—1,1—二甲基—乙基)—2—甲基硫基—乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 9.02(1H,s) ; 7.89(1H,d) ; 7.77(1H,d) ; 7.62(1H,s) ; 7.42(1H,s) ; 7.20(1H,dd) ; 5.61(1H,s) ; 3.87(3H,s) ; 2.18(3H,s) ; 1.60(3H,s) ; 1.58(3H,s)。

實施例 18

此實施例係例示製備 N—(2—甲氧基亞胺基—1,1—二甲基—乙基)—2—(7—甲基苯並噻唑—5—基氧基)—2—甲基硫基—乙醯胺(第 87 號化合物)：

第一階段：製備 7—甲基—苯並噻唑—5—醇

步驟 1：將 5—胺基—7—甲基苯並噻唑(6 克，36 毫莫耳)溶於硫酸(38 毫升濃硫酸在 550 毫升水中)中，藉加熱懸浮液 2 小時，藉冰將所得溶液冷卻至 0°C 。然後加入亞硝酸鈉(3.1 克，45 毫莫耳)在水(10 毫升)中之溶液，此混合物在相同溫度之下攪拌 1 小時，且於 30 分鐘回溫至 15°C 。然後以脲(1 克)使過量之亞硝酸鹽驟冷。然後，將溶液快速加入回流稀硫酸(22 毫升)(硫酸在 330 毫升水中)，另外持續回流 1 小時。混合物經過濾，濾液經攪拌隔夜，於乙酸乙酯中萃取。經合併的有機萃取物經水、鹽水沖洗，經乾燥。在真空之下蒸發溶劑，製得 1 克 5—羥基—7—甲基苯並噻唑，

其供下一道步驟使用。

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 9.0(1H,s) ; 7.47(1H,d) ; 6.88(1H,d) ; 2.54(3H,s) ; MS m/z 166 (M+1)。

第二階段：製備 N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(7-甲基苯並噻唑-5-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺

依類似於實施例 1、第一階段(步驟 1 至 2)和第二階段(步驟 1)之方式自 5-羥基-7-甲基苯並噻唑製備 N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(7-甲基苯並噻唑-5-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺，其中使用來自實施例 2 步驟 4 之 2-胺基-2-甲基-丙醛 O-甲基-肟取代實施例 1 第二階段步驟 1 之 2-胺基-2-甲基-1-丙醇。

第 87 號化合物：N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(7-甲基苯並噻唑-5-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 9.00(1H,s) ; 7.61(1H,d) ; 7.42(1H,s) ; 7.01(1H,s) ; 5.59(1H,s) ; 3.87(3H,s) ; 2.59 (3H,s) ; 2.18(3H,s) ; 1.60(3H,s) ; 1.58(3H,s) ; 熔點為 148 至 150°C。

實施例 19

此實施例係例示製備 2-(苯並噁唑-5-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺(第 88 號化合物)：

步驟 1：依類似於實施例 1、第一階段(步驟 1 至 2)和

第二階段(步驟 1)之方式自苯並噁唑-5-醇製備 2-(苯並噁唑-5-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺，其中使用來自實施例 2 步驟 4 之 2-胺基-2-甲基-丙醛 O-甲基-肟取代實施例 1 第二階段步驟 1 之 2-胺基-2-甲基-1-丙醇。

第 88 號化合物： ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm：8.10(1H,s)；7.59(1H,s br)；7.56(1H,s br)；7.53(1H,d)；7.44(1H,d)；7.42(1H,s)；7.11 (1H,dd)；5.52(3H,s)；3.87(3H,s)；2.17(1H,s)；1.60(3H,s)；1.58(3H,s)；熔點為 95 至 96°C。

實施例 20

實施例 20 提供部分列於以上所引述表的化合物的 NMR 數據及/或熔點且已使用類似實施例 1 至 19 所述程序，除非特別特定。除非特別特定，所記載之 ^1H NMR 訊號為主要非對映異構物之特徵。

第 89 號化合物：N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(4-甲基苯並噁唑-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm：8.87(1H,s)；7.54(1H,s br)；7.41(1H,s)；7.38(1H,d)；7.03(1H,d)；5.54(1H,s)；3.86(3H,s)；2.75(3H,s)；2.17(3H,s)；1.58(3H,s)；1.56(3H,s)。

第 90 號化合物：2-(3,8-二氯-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：熔點為 158 至 161°C。

第 91 號化合物：N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基

—乙基)—2—(8—甲基—喹啉—6—基氧基)—2—甲基硫
基—乙醯胺：熔點為 109 至 112°C。

第 92 號化合物：2—(3—碘—喹啉—6—基氧基)—N—
(3—甲氧基亞胺基—1,1—二甲基—丙基)—2—甲基硫基—
乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm：8.88(1H,d)；8.39(1H, d)；
7.95(1H, d)；7.39(1H, m)；[{7.30(t), 6.66(t)1H}], 異構物
A 和異構物 B]；7.07(1H,d)；[{6.77(s, br), 6.54(s, br) 3H}],
異構物 A 和異構物 B]；[{5.50(s), 5.47(s)1H}], 異構物 A
和異構物 B]；[{3.82(s), 3.74(s)3H}], 異構物 A 和異構物
B]；[{3.38—3.43(m), 2.57(d, d)2H}], 異構物 A 和異構物
B]；[{2.13(s), 2.12(s)3H}], 異構物 A 和異構物 B]；
1.38(6H,s)。熔點為 117 至 118°C。

第 93 號化合物：2—(3—溴—喹啉—6—基氧基)—N—
(2—甲氧基亞胺基—乙基)—2—甲基硫基—乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm：8.79(1H, d), 8.15(1H, d)；
8.06(1H,d)；7.43(1H, m)；7.38(1H, m)；7.18(1H, m)；
7.09(1H, m, br)；5.69(1H, d)；4.06(2H, m)；3.77(3H,s)；
3.24(1H, s)；2.13(3H, d)。

第 94 號化合物：2—(3—溴—喹啉—6—基氧基)—N—
(2—甲氧基亞胺基—1—甲基—乙基)—2—甲基硫基—乙醯
胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm：8.50(1H,d)；8.21(1H, d)；
8.07(1H, d)；[{7.50(m), 7.46(m)1H}], 異構物 A 和異構物

B]; [{7.41(d), 7.40(d)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; 7.25(1H, s, br); [{5.76(s), 5.74(s)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; [{4.82(m), 4.75(m)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; [{3.91(d), 3.78(d)3H}, 異構物 A 和異構物 B]; 3.32(1H, s); 2.18(3H, d); [{1.42(d), 1.38(d)3H}, 異構物 A 和異構物 B];

第 95 號化合物：2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(3-甲氧基亞胺基-1, 1-二甲基-丙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.85(1H, d), 8.21(1H, d); 8.07(1H, d); 7.47(1H, m); 7.38(1H, m); 6.65(1H, s, br); 5.61(1H, d); 3.81(3H, d); 3.31(1H, d); 2.66(2H, dd); 2.20(3H, d); 1.46(6H, d)。

第 96 號化合物：N-[1, 1-二甲基-3-(四氫-吡喃-2-基氧基亞胺基)-丙基]-2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.95(1H, d); 8.44(1H, d); 7.52(1H, m); 7.33(1H, s, br); 6.99(1H, s, br); [{6.66(s, br), 6.59(s, br)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; 5.59(1H, s), 5.21(1H, s, br); 3.80-3.92(1H, m), 3.50-3.65(1H, m), 2.77(3H, s); 2.68-2.77(2H, m); 2.20(3H, s); 1.40-1.86(6H, m); 1.40-1.48(6H, m)。熔點為 105 至 106°C。

第 97 號化合物：N-(3-丁氧基亞胺基-1-甲基-丙基)-2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.96(1H,d) ; 8.43(1H, d) ;
 [{7.40(t), 6.72(t)1H}, 異構物 A 和 異構物 B] ; 7.32(1H, s, br) ; 6.98(1H, d) ; [{6.76(s, br), 6.66(s, br)1H}, 異構物 A 和 異構物 B] ; [{5.58(s), 5.55(s)1H}, 異構物 A 和 異構物 B] ; 4.10(t) ; 4.02(t)2H}, 異構物 A 和 異構物 B] ; [{2.82(t), 2.65(d)2H}, 異構物 A 和 異構物 B] ; 2.77(3H, S) ; [{2.21(s), 2.19(s)3H}, 異構物 A 和 異構物 B] ; 1.57—1.67(2H,m) ; 1.47(6H, s) ; 1.31—1.41(2H, m) 0.88—0.95(3H, m)。

第 98 號化合物 : N-(3-苄基氧基亞胺基-1, 1-二甲基-丙基)-2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺 :

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.96(1H,d) ; 8.42(1H, d) ;
 [{7.48(t), 6.77(t)1H}, 異構物 A 和 異構物 B] ; 7.32—7.36(6H, m) ; [{6.97(d), 6.95(d)1H}, 異構物 A 和 異構物 B] ; [{6.71(s, br), 6.61(s, br)1H}, 異構物 A 和 異構物 B] ; [{5.56(s) ; 5.53(s)1H}, 異構物 A 和 異構物 B] ; [{5.15(s), 5.07(s)2H}, 異構物 A 和 異構物 B] ; [{2.85—2.96(m), 2.70(d)2H}, 異構物 A 和 異構物 B] ; 2.76(3H,s) ; 2.19(3H, s) ; [{1.48(s), 1.45(s)6H}, 異構物 A 和 異構物 B]。

第 99 號化合物 : N-(3-烯丙氧基亞胺基-1, 1-二甲基-丙基)-2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺 :

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.95(1H,d) ; 8.42(1H, d) ;
 [{7.44(t), 6.73(t)1H}, 異構物 A 和 異構物 B] ; 7.31(1H, s) ;

6.98(1H, d); [{6.78(s, br), 6.62(s, br)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; 5.89–6.04(1H, m); [{5.58(s), 5.55(s)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; 5.17–5.32(2H, m); [{4.60(d); 4.52(d)2H}, 異構物 A 和異構物 B]; [{2.80–2.92(m), 2.68(d)2H}, 異構物 A 和異構物 B]; [{2.76(3H, s), 2.20(s)3H}, 異構物 A 和異構物 B]; [{1.48(s), 1.47(s)6H}, 異構物 A 和異構物 B]。

第 100 號化合物：N-(3-三級丁氧基亞胺基-1, 1-二甲基-丙基)-2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.96(1H, d); 8.43(1H, d); [{7.38(t), 6.71(t)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; 7.32(1H, s, br); 6.98(1H, s, br); 6.60(1H, s, br); [{5.58(s), 5.54(s)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; [{2.81–2.85(m), 2.64–2.66(m)2H}, 異構物 A 和異構物 B]; 2.77(3H, s); [{2.22(s); 2.19(s)3H}, 異構物 A 和異構物 B]; 1.48(6H, s); [{1.30(s), 1.27(s)9H}, 異構物 A 和異構物 B]。熔點為 130 至 131°C。

第 101 號化合物：N-(3-羥基亞胺基-1, 1-二甲基-丙基)-2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.99(1H, s, br); 8.49(1H, s, br); [{7.45(t), 6.85(t)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; 7.32(1H, s, br); 7.00(1H, s, br); [{6.97(s, br), 6.59(s, br)1H}, 異構物 A 和異構物 B]; [{5.59(s), 5.58(s)1H}, 異構物 A

和異構物 B]；[{2.86(t)；2.72(d)2H}，異構物 A 和異構物 B]；2.79(3H，s)；[{2.21(s)，2.21(s)3H}，異構物 A 和異構物 B]；[{1.53(d)，1.47(s)6H}，異構物 A 和異構物 B]。熔點為 68 至 69℃。

第 102 號化合物：2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-(3-甲氧基-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-丙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm：8.97(1H，d)；8.45(1H，d)；7.51(1H，d) 異構物 A；6.83(1H，t)異構物 B]；7.34(1H，s，br) 異構物 A；7.33(1H，s，br) 異構物 B；6.99(1H，d)；6.64(1H，s，br)異構物 B；6.59(1H，s，br)異構物 A；5.59(1H，s)異構物 A；5.57(1H，s)異構物 B；5.13(2H，t) 異構物 B；5.03(2H，d)異構物 A；3.45(3H，s) 異構物 B；3.40(3H，s) 異構物 A；2.90-3.01(2H，m)；2.78(3H，s) 異構物 B；2.74(3H，s) 異構物 A；2.22(3H，d)；1.49(6H，s)。

第 103 號化合物：2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-(3-甲氧基-乙氧基亞胺基-1,1-二甲基-丙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm：8.97(1H，d)，8.45(1H，d)；7.74(1H，t)；7.34(1H，d)；7.00(1H，d)；6.53(1H，s，br)；5.60(1H，s)；4.11(2H，s)；3.47(3H，s)；2.95(2H，t)；2.78(3H，s)；2.21(3H，s)；1.50(3H，s)；1.47(3H，s)。熔點為 95 至 96℃。

第 104 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N

—(3-甲氧基-亞胺基-1,1-二甲基-丁基)-2-甲基硫
基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.79(1H, d) ; 8.23(1H, d) ;
8.02(1H, d) ; [$\{7.77(\text{s}, \text{br}), 7.34(\text{s}, \text{br})1\text{H}\}$, 異構物 A 和
異構物 B] ; 7.48(1H, m) ; 7.18(1H, d) ; [$\{5.57(\text{s}), 5.48(\text{s})1\text{H}\}$,
異構物 A 和異構物 B] ; [$\{3.85(\text{s}), 3.81(\text{s})3\text{H}\}$, 異構物 A
和異構物 B] ; 2.42—2.51(2H, m) ; [$\{2.19(\text{s}) ; 2.15(\text{s})3\text{H}\}$,
異構物 A 和異構物 B] ; [$\{1.92(\text{s}), 1.87(\text{s})3\text{H}\}$, 異構物 A
和異構物 B] ; [$\{1.49(\text{s}), 1.47(\text{s})6\text{H}\}$, 異構物 A 和異構物
B]。

第 105 號化合物：2-(3-碘-8-甲基-喹啉-6-基
氧基)-N-(3-甲氧基-亞胺基-1-甲基-丙基)-2-甲
基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.92(1H, d) ; 8.41(1H, d) ;
[$\{7.39(\text{t}), 6.68(\text{t})1\text{H}\}$, 異構物 A 和異構物 B] ; 7.30(1H,
m) ; 6.95(1H, m) ; 6.75(1H, m), 5.62—5.65(1H, M) ; 4.27
—4.34(1H, m) ; 3.69—3.91(3H) ; 2.74(3H, s) ; 2.34—
2.50(2H, m) ; 2.14—2.17(3H, m) ; 1.19—1.31(3H, m)。熔
點為 95 至 96 $^{\circ}\text{C}$ 。

第 106 號化合物：2-(8-氯-3-碘-喹啉-6-基氧
基)-N-(2-甲氧基-亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2
-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 9.03(1H, d), 8.47(1H, d) ;
7.61(1H, d) ; 7.55(1H, s, br) ; 7.38(1H, s) ; 7.08(1H, d) ;

5.61(1H, s); 3.87(3H, s); 2.16(3H, s); 1.59(3H, s); 1.56(3H, s)。熔點為 191 至 192°C。

第 107 號化合物：2-(3-溴-8-甲氧基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基-亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.77(1H, d), 8.18(1H, d); 7.52(1H, s, br); 7.39(1H, s); 6.80(1H, d); 6.72(1H, d); 5.62(1H, s); 4.06(3H, s); 3.85(3H, s); 2.20(3H, s); 1.58(3H, s); 1.56(3H, s)。

第 108 號化合物：2-(3-溴-1-氧基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基-亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.61(1H, d), 8.51(1H, d); 7.80(1H, s); 7.58(1H, s, br); 7.42(1H, m); 7.38(1H, s); 7.20(1H, d); 5.64(1H, s); 3.86(3H, s); 2.18(3H, s); 1.59(3H, s); 1.56(3H, s)。

第 109 號化合物：N-(2-苄基氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.82(1H, d), 8.23(1H, d); 8.03(1H, d); 7.58(1H, s, br); 7.47(1H, s); 7.30-7.36(6H, m); 7.15(1H, d); 5.62(1H, s); 5.10(2H, s); 2.15(3H, s); 1.61(3H, s); 1.58(3H, s)。

第 110 號化合物：N-(2-苄基氧基亞胺基-1,1-二

甲基-乙基)-2-(3-溴-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-
2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.82(1H, d), 8.20(1H, d);
7.59(1H, s, br); 7.48(1H, s); 7.29-7.38(6H, m); 7.00(1H, d);
5.61(1H, s); 5.10(2H, s); 2.77(3H, s); 2.51(3H, s);
1.58(3H, s); 1.61(3H, s)。

第 111 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-
-{2-[(E 或 Z)-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-丙基)-2-
-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.81(1H, d), 8.36(1H, s br);
8.24(1H, d); 8.03(1H, d); 7.45-7.48(1H, d, d); 7.17(1H, s);
5.63(1H, s); 3.92(3H, s); 2.20(3H, s); 1.85(3H, s);
1.63(3H, s); 1.58(3H, s)。

第 112 號化合物：2-(3-乙炔基-8-甲基-喹啉-6-
-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-
-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.86(1H, d), 8.17(1H, d);
7.56(1H, s br); 7.41(1H, s); 7.33(1H, dd); 7.05(1H, d);
5.63(1H, s); 3.88(3H, s); 3.28(1H, s); 2.78(3H, s); 2.20(3H, s);
1.60(3H, s); 1.57(3H, s)。

第 113 號化合物：N-(2-乙氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-乙炔基-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-
-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.86(1H, d), 8.17(1H, d);

7.56(1H, s, br); 7.40(1H, s); 7.32(1H, dd); 7.05(1H, d); 5.63(1H, s); 4.10–4.15(2H, q); 3.28(1H, s); 2.78(3H, s); 2.20(3H, s); 1.60(3H, s); 1.57(3H, s); 1.28(3H, t)。

第 114 號化合物：N-(2-烯丙基氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-乙炔基-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.86(1H, d), 8.17(1H, d); 7.60(1H, s, br); 7.45(1H, s); 7.32(1H, dd); 7.05(1H, d); 5.94–6.04(1H, m); 5.63(1H, s); 5.22–5.35(2H, m); 4.57(2H, d, d); 3.28(1H, s); 2.78(3H, s); 2.19(3H, s); 1.61(3H, s); 1.58(3H, s)。

第 115 號化合物：2-(8-氯-3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.95(1H, d), 8.22(1H, d); 7.64(1H, d); 7.57(1H, s, br); 7.40(1H, s); 7.17(1H, d); 5.64(1H, s); 3.89(3H, s); 3.34(1H, s); 2.20(3H, s); 1.60(3H, s); 1.58(3H, s)。

第 116 號化合物：2-(8-氯-3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-乙氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.95(1H, d), 8.22(1H, d); 7.65(1H, s, br); 7.63(1H, d); 7.39(1H, s); 7.16(1H, d); 5.63(1H, s); 4.11–4.16(2H, q); 3.34(1H, s); 2.20(3H, s);

1.60(3H, s); 1.58(3H, s); 1.29(3H, t)。

第 117 號化合物：N-(2-烯丙基氧基亞胺基-1, 1-二甲基-乙基)-2-(8-氯-3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.95(1H, d), 8.22(1H, d); 7.63(1H, d); 7.44(1H, s); 7.16(1H, d); 5.95–6.05(1H, m); 5.63(1H, s); 5.25–5.36(2H, m); 4.59(2H, d); 3.34(1H, s); 2.19(3H, s); 1.61(3H, s); 1.58(3H, s)。

第 118 號化合物：N-(2-乙氧基亞胺基-1, 1-二甲基-乙基)-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.85(1H, d), 8.21(1H, d); 8.07(1H, d); 7.67(1H, s br); 7.44–7.47(1H, d, d); 7.40(1H, s); 7.22(1H, d); 5.65(1H, s); 4.13(2H, q); 3.29(1H, s); 2.20(3H, s); 1.61(3H, s); 1.58(3H, s); 1.28(3H, t)。

第 119 號化合物：N-(2-乙氧基亞胺基-1, 1-二甲基-乙基)-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.85(1H, d), 8.20(1H, s); 8.07(1H, d); 7.67(1H, s br); 7.44–7.47(1H, d, d); 7.40(1H, s) 異構物 A, 6.70(1H, s) 異構物 B; 7.22(1H, d); 5.65(1H, s) 異構物 A, 5.61(1H, s) 異構物 B; 4.00–4.15(2H, m) 異構物 A 與 B; 3.29(1H, s); 2.20(3H, s); 1.58–1.65(6H, t)。

第 120 號化合物：N-(2-烯丙基氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm：8.85(1H, d), 8.21(1H, d); 8.07(1H, d); 7.62(1H, s br); 7.44–7.47(1H, d, d); 7.22(1H, d); 5.94–6.03(1H, m); 5.64(1H, s); 5.22–5.34(2H, m); 4.57(2H, d); 3.29(1H, s); 2.19(3H, s); 1.61(3H, s); 1.58(3H, s)。

第 121 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-{2-[(E 或 Z)-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-3-苯基-丙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm：8.82(1H, d), 8.24(2H, m); 8.07(1H, d); 7.44–7.47(1H, d, d); 7.24–7.27(1H, m); 7.13–7.20(4H, m); 5.60(1H, s); 3.95(3H, s); 3.72–3.81(2H, m); 2.19(3H, s); 1.58(3H, s); 1.55(3H, s)。

第 122 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-{2-[(E 或 Z)-乙氧基亞胺基-1,1-二甲基-3-苯基-丙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm：8.82(1H, d), 8.31(1H, s br); 8.24(1H, d); 8.06(1H, d); 7.43–7.46(1H, d, d); 7.26(1H, m); 7.15–7.23(4H, m); 5.60(1H, s); 4.15–4.23(2H, m); 3.73–3.82(2H, m); 2.19(3H, s); 1.58(3H, s); 1.56(3H, s); 1.28(3H, t)。

第 123 號化合物：N-{2-[(E 或 Z)-烯丙基氧基亞胺

基]— — 1, 1-二甲基-3-苯基-丙基}-2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.82(1H, d), 8.23(1H, s br); 8.23(1H, d); 8.06(1H, d); 7.43–7.46(1H, d, d); 7.15–7.26(5H, m); 5.93–6.03(1H, m); 5.58(1H, s); 5.18–5.28(2H, m); 4.64(2H, d); 3.75–3.84(2H, m); 2.19(3H, s); 1.59(3H, s); 1.56(3H, s)。

第 124 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-{2-[(E 或 Z)-甲氧基亞胺基-1, 1-二甲基-3-噻吩-3-基丙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.82(1H, d), 8.23(1H, d); 8.20(1H, s br); 8.06(1H, d); 7.44–7.47(1H, d, d); 7.16–7.22(2H, m); 6.91–6.96(2H, m); 5.61(1H, s); 3.96(3H, s); 3.66–3.74(2H, m); 2.19(3H, s); 1.60(3H, s); 1.57(3H, s)。

第 125 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-{2-[(E 或 Z)-乙氧基亞胺基-1, 1-二甲基-3-噻吩-3-基丙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 8.82(1H, d), 8.27(1H, s br); 8.23(1H, d); 8.03–8.06(1H, d); 7.43–7.46(1H, d, d); 7.21(1H, m); 7.17(1H, d); 6.93–6.98(2H, m); 5.61(1H, s); 4.16–4.24(2H, m); 3.66–3.75(2H, m); 2.19(3H, s); 1.60(3H, s); 1.57(3H, s); 1.32(3H, t)。

第 126 號化合物：N-{2-[(E 或 Z)-烯丙基氧基亞胺

基]-1, 1-二甲基-3-噻吩-3-基-丙基}-2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.82(1H, d), 8.23(1H, d); 8.18(1H, s br); 8.03-8.06(1H, d); 7.43-7.46(1H, d, d); 7.21(1H, m); 7.17(1H, d); 6.94-6.99(2H, m); 5.95-6.04(1H, m); 5.59(1H, s); 5.20-5.31(2H, m); 4.65(2H, d); 3.69-3.77(2H, m); 2.18(3H, s); 1.60(3H, s); 1.58(3H, s)。

第 127 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-{2-[(E 或 Z)-甲氧基亞胺基-1, 1-二甲基-3-吡啶-2-基丙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 9.37(1H, s); 8.79(1H, d), 8.48(1H, d); 8.20(1H, d); 7.93(1H, d); 7.60-7.64(1H, m); 7.22-7.30(2H, m); 7.13-7.22(2H, m); 5.59(1H, s); 3.68-3.83(5H, m); 2.25(3H, s); 1.70(3H, s); 1.64(3H, s)。

第 128 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-{2-[(E 或 Z)-乙氧基亞胺基-1, 1-二甲基-3-吡啶-2-基丙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 9.39(1H, s); 8.79(1H, d), 8.48(1H, d); 8.20(1H, d); 7.93(1H, d); 7.59-7.63(1H, m); 7.23-7.30(2H, m); 7.13-7.15(2H, m); 5.60(1H, s); 3.99-4.08(2H, q); 3.68-3.83(2H, m); 2.25(3H, s); 1.71(3H, s); 1.64(3H, s); 1.11(3H, t)。

第 129 號化合物：N- {2- [(E 或 Z)- 烯丙基氧基亞胺基] - 1, 1- 二甲基 - 3- 吡啶 - 2- 基 - 丙基} - 2- (3- 溴 - 喹啉 - 6- 基氧基) - 2- 甲基硫基 - 乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm：9.40(1H, s)；8.79(1H, d)，8.48(1H, d)；8.20(1H, d)；7.93(1H, d)；7.59 - 7.64(1H, m)；7.24 - 7.29(2H, m)；7.13 - 7.16(2H, m)；5.74 - 5.84(1H, m)；5.59(1H, s)；5.05 - 5.10(2H, m)；4.47(2H, d)；3.69 - 3.85(2H, m)；2.25(3H, s)；1.71(3H, s)；1.64(3H, s)。

第 130 號化合物：2- (3- 溴 - 喹啉 - 6- 基氧基) - N- {2- [(E 或 Z)- 甲氧基亞胺基 - 1, 1- 二甲基 - 2- 苯基 - 乙基) - 2- 甲基硫基 - 乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm：8.83(1H, d)；8.29(1H, s br)，8.25(1H, d)；8.05(1H, d)；7.40 - 7.49(4H, m)；7.18(1H, d)；7.12 - 7.15(2H, m)；5.66(1H, s)；3.85(3H, s)；2.21(3H, s)；1.65(3H, s)；1.62(3H, s)；

第 131 號化合物：2- (3- 乙炔基 - 喹啉 - 6- 基氧基) - N- (2- 甲氧基亞胺基 - 1, 1- 二甲基 - 乙基) - 丁醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm：8.82(1H, d)，8.15(1H, d)；8.04(1H, d)；7.45(1H, dd)；7.30(1H, s)；7.20(1H, s br)；7.05(1H, d)；4.59(1H, m)；3.76(3H, s)；3.28(1H, s)；2.06(2H, m)；1.49(3H, s)；1.44(3H, s)；1.08(3H, t)。

第 132 號化合物：2- (3- 乙炔基 - 8- 甲基 - 喹啉 - 6- 基氧基) - N- (2- 甲氧基亞胺基 - 1, 1- 二甲基 - 乙基) - 丁醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.83(1H, d), 8.12(1H, d); 7.31(2H, m); 7.18(1H, s br); 6.88(1H, d); 4.58(1H, m); 3.77(3H, s); 3.27(1H, s); 2.77(3H, s); 2.02(2H, m); 1.49(3H, s); 1.43(3H, s); 1.07(3H, t)。

第 133 號化合物 : 2-(3-溴-8-乙基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1, 1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺 :

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.80(1H, d); 8.21(1H, d), 7.62(1H, s br); 7.41(1H, s); 7.32(1H, d); 7.0(1H, d); 5.63(1H, s); 3.88(3H, s); 3.24(2H, q); 2.20(3H, s); 1.61(3H, s); 1.58(3H, s); 1.37(3H, t)。

第 134 號化合物 : 2-(3-乙炔基-7-氟-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1, 1-二甲基-乙基)-丁醯胺 :

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.84(1H, d), 8.15(1H, d); 7.77(1H, d); 7.37(1H, s br); 7.30(1H, s); 7.12(1H, d); 4.66(1H, t); 3.80, 3.28(4H, m); 2.10(2H, m); 1.51(3H, s); 1.46(3H, s); 1.09(3H, t)。

第 135 號化合物 : N-2-乙氧基亞胺基-1, 1-二甲基-乙基)-2-(3-乙炔基-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-丁醯胺 :

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.82(1H, d), 8.11(1H, d); 7.27-7.31(3H, m); 6.88(1H, d); 4.57(1H, m); 3.90-4.05(2H, m); 3.27(1H, s); 2.76(3H, s); 1.97-2.10(2H,

m); 1.50(3H, s); 1.43(3H, s); 1.17(3H, t); 1.08(3H, t)。

熔點為 105–107°C。

第 136 號化合物：2-(3-乙炔基-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-異丁氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-丁醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.88(1H, d), 8.19(1H, d); 7.21–7.33(3H, m); 6.91(1H, d); 4.57(1H, m); 3.66–3.74(2H, m); 3.30(1H, s); 2.81(3H, s); 1.97–2.10(2H, m); 1.81–1.90(1H, s); 1.50(3H, s); 1.44(3H, s); 1.08(3H, t); 0.85–0.87(6H, m)。

第 137 號化合物：N-(2-三級丁氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-乙炔基-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-丁醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.85(1H, d), 8.15(1H, d); 7.52(1H, s); 7.33(1H, d); 7.18(1H, s); 6.88(1H, d); 4.57(1H, m); 3.28(1H, s); 2.77(3H, s); 2.01–2.08(2H, m); 1.52(3H, s); 1.43(3H, s); 1.16(9H, s); 1.08(3H, t)。熔點為 130–132°C。

第 138 號化合物：N-(2-烯丙基氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-乙炔基-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-丁醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.88(1H, d), 8.20(1H, d); 7.34(2H, m); 7.21(1H, s); 6.90(1H, d); 5.84–5.93(1H, m); 5.12–5.26(2H, m); 4.57(1H, m); 4.44(2H, m); 3.00(1H,

s); 2.82(3H, s); 1.97–2.10(2H, m); 1.50(3H, s); 1.44(3H, s); 1.07(3H, t)。熔點為 81–84°C。

第 139 號化合物：2-(3-乙炔基-8-甲基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-羥基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-丁醯胺：

^1H NMR (DMSO- d_6) δ ppm: 10.55(1H, s); 8.76(1H, d), 8.34(1H, d); 8.09(1H, s); 7.39(1H, s); 7.08(1H, d); 4.65(1H, t); 4.50(1H, s); 2.66(3H, s); 1.87(2H, m); 1.37(3H, s); 1.36(3H, s); 0.97(3H, t)。熔點為 134 至 135°C。

第 140 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-氰甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.81(1H); 8.25(1H, d), 8.05(1H, d); 7.64(1H, s); 7.50(1H, dd); 7.25(1H, s); 7.21(1H, d); 5.64(1H, s); 4.68(2H, s); 2.18(3H, s); 1.61(3H, s); 1.60(3H, s)。

第 141 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-丁-2-炔基氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.74(1H, d); 8.20(1H, d), 7.98(1H, d); 7.62(1H, s br); 7.45(1H, dd); 7.39(1H, s); 7.13(1H, d); 5.57(1H, s); 4.58(2H, q); 2.12(3H, s); 1.79(3H, t); 1.55(3H, s); 1.52(3H, s)。

第 142 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N

— [2—(2—氟—乙氧基亞胺基)—1, 1—二甲基—乙基]—2—甲基硫基—乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.82(1H, d) ; 8.25(1H, d) , 8.07(1H, d) ; 7.51(1H, s) ; 7.43—7.47(2H, m) ; 7.18(1H, d) ; 5.64(1H, s) ; 4.70(1H, m) ; 4.58(1H, m) ; 4.34(1H, m) ; 4.28(1H, m) ; 2.19(3H, s) ; 1.61(3H, s) ; 1.59(3H, s) 。

第 143 號化合物：2—(3—溴—喹啉—6—基氧基)—N—[1, 1—二甲基—2—(四氫—呋喃—2—基甲氧基亞胺基)—乙基]—2—甲基硫基—乙醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.81(1H, d) ; 8.26(1H, d) , 8.07(1H, d) ; 7.59(1H, s br) ; 7.45(2H, m) ; 7.18(1H, d) ; 5.62(1H, s) ; 4.01—4.19(3H, m) ; 3.74—3.91(2H, m) ; 2.17(3H, s) ; 1.85—2.03(3H, m) ; 1.60—1.67(1H, m) ; 1.59(3H, s) ; 1.56(3H, s) 。

第 144 號化合物：2—(3—溴—喹啉—6—基氧基)—N—(2—甲氧基亞胺基—1, 1—二甲基—乙基)—丁醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm : 8.80(1H, d) ; 8.22(1H, d) , 8.06(1H, d) ; 7.47(1H, dd) ; 7.32(1H, s) ; 7.20(1H, s br) ; 7.03(1H, d) ; 4.60(1H, m) ; 3.78(3H, s) ; 2.0—2.13(2H, m) ; 1.51(3H, s) ; 1.46(3H, s) ; 1.10(3H, t) 。熔點為 90 至 93℃ 。

第 145 號化合物：2—(3—溴—8—甲基—喹啉—6—基氧基)—N—(2—甲氧基亞胺基—1, 1—二甲基—乙基)—丁

醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.81(1H, d); 8.18(1H, d), 7.33(2H, s br); 7.18(1H, s br); 6.87(1H, d); 4.59(1H, m); 3.79(3H, s); 2.78(3H, s); 1.99–2.11(2H, m); 1.51(3H, s); 1.46(3H, s); 1.09(3H, t)。熔點為 87 至 89°C。

第 146 號化合物：2-(3-溴-8-氯-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-丁醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.92(1H, d); 8.24(1H, d), 7.64(1H, d); 7.30(1H, s); 7.21(1H, s br); 6.97(1H, d); 4.59(1H, m); 3.80(3H, s); 2.01–2.13(2H, m); 1.52(3H, s); 1.46(3H, s); 1.10(3H, t)。熔點為 104 至 110°C。

第 147 號化合物：2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-N-(2-羥基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-丁醯胺：

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 10.56(1H, s); 8.75(1H, d), 8.40(1H, d); 8.13(1H, s); 7.95(1H, d); 7.50(1H, m); 7.40(1H, s); 7.26(1H, d); 4.70(1H, t); 4.52(1H, s); 1.86–1.94(2H, m); 1.37(6H, s); 0.99(3H, t)。熔點為 59 至 61°C。

第 148 號化合物：N-(2-乙氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-丁醯胺：

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$) δ ppm: 8.75(1H, d), 8.39(1H, d); 8.20(1H, s); 7.95(1H, d), 7.49(1H, m); 7.46(1H, s); 7.25(1H, d); 4.68(1H, t); 4.52(1H, s); 3.90(2H, q); 1.90(2H,

m); 1.36(6H, s); 1.09(3H, t); 1.00(3H, t)。熔點為 84—85°C。

第 149 號化合物：N-(2-烯丙基氧基亞胺基-1, 1-二甲基-乙基)-2-(3-乙炔基-喹啉-6-基氧基)-丁醯胺：

^1H NMR (DMSO- d_6) δ ppm: 8.75(1H, d), 8.39(1H, d); 8.22(1H, s); 7.95(1H, d); 7.52(1H, s); 7.49(1H, m); 7.25(1H, d); 5.82—5.92(1H, m); 5.11—5.23(2H, m); 4.68(1H, t); 4.52(1H, s); 4.40(2H, d); 1.90(2H, m); 1.36(6H, s); 1.00(3H, t)。熔點為 84—86°C。

第 150 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-(2-羥基亞胺基-1, 1-二甲基-乙基)-丁醯胺：

^1H NMR (DMSO- d_6) δ ppm: 10.55(1H, s); 8.79(1H, d); 8.58(1H, d), 8.12(1H, s); 7.97(1H, d); 7.50(1H, m); 7.40(1H, s); 7.24(1H, d); 4.67(1H, t); 1.89(2H, m); 1.37(6H, s); 0.99(3H, t)。熔點為 156 至 157°C。

第 151 號化合物：2-(3-溴-喹啉-6-基氧基)-N-[2-(2-氟-乙氧基亞胺基-1, 1-二甲基-乙基)-丁醯胺：

MP ^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.81(1H, d); 8.22(1H, d), 8.06(1H, d); 7.43—7.46(2H, m); 7.09(1H, s br); 7.02(1H, d); 4.52—4.65(2H, m); 4.44—4.53(1H, m); 4.11—4.27(2H, m); 2.01—2.12(2H, m); 1.52(3H, s); 1.10(3H, t)。熔點為 108 至 112°C。

第 152 號化合物：N-(2-羥基亞胺基-1,1-二甲基-乙基 2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-丁醯胺：

^1H NMR (DMSO- d_6) δ ppm: 10.56(1H, s); 8.88(1H, d); 8.70(1H, d), 8.10(1H, s); 7.91(1H, d); 7.48(1H, m); 7.40(1H, d); 7.20(1H, d); 4.66(1H, t); 1.89(2H, m); 1.37(6H, s); 0.98(3H, t)。熔點為 157 至 160°C。

第 153 號化合物：N-(2-羥基亞胺基-1,1-二甲基-乙基 2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-2-甲基硫基-乙醯胺：

^1H NMR (DMSO- d_6) δ ppm: 10.65(1H, s); 8.92(1H, d); 8.76(1H, d), 8.17(1H, s); 7.95(1H, m); 7.58(1H, m); 7.46(1H, d); 7.38(1H, s); 5.94(1H, s); 2.14(3H, s); 1.43(6H, s)。熔點為 194 至 196°C。

第 154 號化合物：2-(3-溴-7-氟-喹啉-6-基氧基)-N-(2-甲氧基亞胺基-1,1-二甲基-乙基)-丁醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.80(1H, d); 8.18(1H, d), 7.74(1H, d); 7.36(1H, s br); 7.31(1H, s); 7.08(1H, d); 4.65(1H, t); 3.80(3H, s); 2.05-2.14(2H, m); 1.51(3H, s); 1.46(3H, s); 1.09(3H, t)。

第 155 號化合物：N-[2-(2-氟-乙氧基亞胺基)-1,1-二甲基-乙基]-2-(3-碘-喹啉-6-基氧基)-丁醯胺：

^1H NMR (CDCl_3) δ ppm: 8.95(1H, s); 8.51(1H, s),

8.10(1H, d); 7.49(1H, d); 7.42(1H, s); 7.08(1H, s); 7.01(1H, s); 4.45—4.67(3H, m); 4.15—4.25(2H, m); 2.0—2.12(2H, m); 1.51(3H, s); 1.48(3H, s); 1.09(3H, t)。熔點為 83 至 84°C。

實施例 21

本實施例說明式 (I) 化合物之殺真菌特性。

化合物以水性懸浮液經測試對抗一組吾人的標準篩選植病系統。以 1 或 2 天預防性投藥進行預防性試驗，亦即在以人工方式接種真菌孢子之前 1 至 2 天以該化合物處理植物，然而對治療試驗而言，在投藥之前 1 或 2 天接種真菌孢子。以投藥裝置進行 500 升/畝進行投與，提供對上葉側及下葉側之覆蓋(轉盤，空氣支撐自 2 噴嘴噴灑)。

視植病系統而定，在接種 4 至 20 天之後，進行疾病控制之單一評估。

化合物以水性懸浮液經測試對抗以下所例示之一組標準篩選植病系統。

以投藥裝置進行 500 升/畝進行葉面投與，提供對上葉側及下葉側之覆蓋(轉盤，空氣支撐自 2 噴嘴噴灑)。以 1 或 2 天預防性投藥進行預防性試驗，亦即在以人工方式接種真菌孢子之前 1 至 2 天以該化合物處理植物，然而對治療試驗而言，在投藥之前 1 或 2 天接種真菌孢子。視植病系統而定，在接種 4 至 20 天之後，進行疾病控制之單一評估。

葉盤試驗

從生長在溫室中之植物切割下各種植物種類之葉盤(直

徑 14 毫米)。將切割下的葉盤置於在瓊脂上的多孔平板(24 孔形式)中。在切割之後，立即對葉盤噴灑試驗溶液。

待試驗的化合物被製備為 DMSO 溶液(最大為 10 毫克/毫升)。就在噴灑之前，以 0.025% Tween20 將溶液稀釋至合適的濃度。在乾燥之後，以合適的病原真菌之孢子懸浮液對葉盤進行接種。

根據個別試驗系統在定義條件(溫度、相對濕度，光線等)下進行接種之後的 3 至 7 天接種時間，評估試驗化合物之活性作為殺真菌活性。

液體培養液試驗：

製備於真菌之新鮮液體培養液或冷凍儲存之菌絲碎片或分生孢子懸浮液被直接混合入營養肉汁。試驗化合物之 DMSO 溶液(最大為 10 毫克/毫升)經 0.025% Tween20 稀釋 50 倍，且 10 微升之此種溶液被吸管吸至微量滴定板(96 孔形式)，然後含有真菌孢子/菌絲碎片之營養肉汁被加入而得到待試驗化合物的最終濃度。試驗平板在黑暗中之 24℃ 及 96% 相對濕度下培育。經過 2 至 6 天之後以光度法測定真菌生長的抑制以及計算殺真菌活性。

植物試驗：

番茄早疫病菌/番茄/預防(番茄上的番茄早疫病菌)：4 週大的番茄植物 cv. Roter Gnom 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥二天之後，藉由在試驗植物上噴灑孢子懸浮液而對番茄植物進行接種。在 22/18℃ 和 95% 相對濕度之溫室中進行 4 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉

子面積百分比。

灰黴病菌/番茄/預防(番茄上的灰黴病菌)：4 週大的番茄植物 cv. Roter Gnom 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥二天之後，藉由在試驗植物上噴灑孢子懸浮液而對番茄植物進行接種。在 20°C 和 95%相對濕度之溫室中進行 3 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

灰黴病菌/葡萄/預防(葡萄上的灰黴病菌)：5 週大的葡萄幼苗 cv. Gutedel 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥二天之後，藉由在試驗植物上噴灑孢子懸浮液而對葡萄植物進行接種。在 20°C 和 95%相對濕度之溫室中進行 3 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

小麥白粉菌/大麥/預防(大麥上的白粉黴菌)：1 週大的大麥植物 cv. Regina 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥二天之後，藉由在試驗植物上搖晃經白粉黴菌感染之植物對大麥植物進行接種。在 20/18°C (日/夜)和 60%相對濕度之溫室中進行 6 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

小麥白粉菌/小麥/預防(小麥上的白粉黴菌)：1 週大的小麥植物 cv. Arina 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥二天之後，藉由在接種室內在試驗植物上噴灑黴菌孢子而對小麥植物進行接種。在 20/18°C (日/夜)和 60%相對濕度之溫室中進行 6 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

小麥白粉菌/小麥/治療(小麥上的白粉黴菌)：在投藥 2 天之前，1 週大的小麥植物 cv. Arina 在接種室中藉由散佈黴菌孢子於試驗植物上而進行接種。該經接種之植物在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在 20/18°C (日/夜)和 60%相對濕度之溫室中進行 6 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

炭疽病菌/胡瓜/預防(小麥上的白粉黴菌)：1 週大的胡瓜植物 cv. Wisconsin 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥一天之後，藉由在接種室內在試驗植物上噴灑孢子懸浮液(1×10^5 孢子/毫升)而對小麥植物進行接種。在墨黑暗中、23°C 和 100%相對濕度中進行 30 小時培育期之後，植物被保持於 23°C/21°C (日/夜)和 70%相對濕度之溫室中達 6 天。評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

晚疫病菌/番茄/預防(番茄上的晚疫病菌)：3 週大的番茄植物 cv. Roter Gnom 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥二天之後，藉由在試驗植物上噴灑孢囊懸浮液而對番茄植物進行接種。在 18°C 和 100%相對濕度之溫室中進行 4 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

晚疫病菌/番茄/治療(番茄上的晚疫病菌)：在投藥 1 天之前，3 週大的番茄植物 cv. Roter Gnom 藉由噴灑孢囊懸浮液於試驗植物上而進行接種。該經接種之植物在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在 18°C 和 100%相對濕度之生長室中進行 4 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積

百分比。

晚疫病菌/番茄/持久性(番茄上的晚疫病菌)：3 週大的番茄植物 cv. Roter Gnom 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥 6 天之後，藉由在試驗植物上噴灑孢囊懸浮液而對番茄植物進行接種。在 18°C 和 100%相對濕度之溫室中進行 4 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

晚疫病菌/馬鈴薯/預防性(馬鈴薯上的晚疫病菌)：2 週大的馬鈴薯植物 cv. Bintje 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥 2 天之後，藉由在試驗植物上噴灑孢囊懸浮液而對植物進行接種。在 18°C 和 100%相對濕度之溫室中進行 4 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

晚疫病菌/馬鈴薯/治療(馬鈴薯上的晚疫病菌)：在投藥 1 天之前，2 週大的番茄植物 cv. Bintje 藉由噴灑孢囊懸浮液於試驗植物上而進行接種。該經接種之植物在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在 18°C 和 100%相對濕度之生長室中進行 4 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

晚疫病菌/馬鈴薯/持久性(番茄上的晚疫病菌)：2 週大的馬鈴薯植物 cv. Bintje 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥 6 天之後，藉由在試驗植物上噴灑孢囊懸浮液而對番茄植物進行接種。在 18°C 和 100%相對濕度之生長室中進行 4 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

葡萄霜黴菌/葡萄/預防(葡萄露菌)：5 週大的葡萄幼苗 cv. Gutedel 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥 1 天之後，藉由在試驗植物下葉側噴灑孢子懸浮液而對葡萄植物進行接種。在 22°C 和 100%相對濕度之溫室中進行 6 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

葡萄霜黴菌/葡萄/治療(葡萄露菌)：在投藥 1 天之前，5 週大的番茄植物 cv. Gutedel 藉由噴灑孢囊懸浮液於試驗植物下葉側而進行接種。該經接種之植物在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在 22°C 和 100%相對濕度之溫室中進行 6 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

葡萄霜黴菌/葡萄/持久性(葡萄露菌)：5 週大的葡萄植物 cv. Gutedel 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥 6 天之後，藉由在試驗植物上噴灑孢囊懸浮液而對葡萄植物下葉側進行接種。在 22°C 和 100%相對濕度之溫室中進行 6 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

白粉病菌/蘋果/預防(蘋果上的白粉病菌)：5 週大的蘋果幼苗 cv. McIntosh 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥 1 天之後，藉由在試驗植物之上搖晃被蘋果白粉病菌感染的植物而對蘋果植物進行接種。在 22°C 和 60%相對濕度及在 14/10 小時(光/暗)之光方案下進行 7 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

葉鏽菌/小麥/預防(小麥褐銹病菌)：1 週大的小麥植物 cv. Arina 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥 1 天之後，藉由在試驗植物之上噴灑孢子懸浮液(1×10^5 夏孢

子/毫升)而對小麥植物進行接種。在 20℃ 和 95%相對濕度之溫室中培育 1 天後，植物被置於 20℃/18℃(日/夜)及在 60%相對濕度之溫室中保持 10 天。接種 11 天之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

葉鏽菌/小麥/治療(小麥褐銹病菌)：在投藥 2 天之前，1 週大的小麥植物 cv. Arina 藉由在試驗植物之上噴灑孢子懸浮液(1×10^5 夏孢子/毫升)而對小麥植物進行接種。在 20℃ 和 95%相對濕度之溫室中培育 1 天以及在 20℃ 和 60%相對濕度之溫室培育 1 天後，該經接種之植物在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在 22℃/18℃(日/夜)和 60%相對濕度之溫室中進行 8 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

葉鏽菌/小麥/持久性(小麥褐銹病菌)：1 週大的小麥植物 cv. Arina 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥 8 天之後，藉由藉由在試驗植物之上噴灑孢子懸浮液(1×10^5 夏孢子/毫升)而對小麥植物進行接種。在 20℃ 和 95%相對濕度 1 天培育期之後，植物於 20℃ 和 60%相對濕度之溫室中被保持 10 天。在接種 11 天之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

稻瘟黴菌/稻米/預防(稻瘟病)：3 週大的稻米植物 cv. Koshihikari 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥 2 天之後，藉由在試驗植物之上噴灑孢子懸浮液(1×10^5 夏孢子/毫升)而對稻米植物進行接種。在 20℃ 和 95%相對濕度之溫室中培育 6 天後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分

比。

球腔菌(*Mycosphaerella arachidis*)(*Cercospora arachidicola*)/花生/預防：3週大的花生植物 cv. Georgia 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥 1 天之後，藉由在試驗植物之下葉表面上噴灑孢子懸浮液(350000 孢子/毫升)而對植物進行接種。在塑膠罩之下及 23℃和 100%相對濕度之溫室中培育 4 天後，植物被置於 23℃/20℃(日/夜)及 70%相對濕度之溫室中。在接種 11 至 12 天之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

球腔菌 (*Mycosphaerella arachidis*) (*Cercospora arachidicola*) /花生/治療：3週大的花生植物 cv. Georgia 藉由在試驗植物之下葉表面上噴灑孢子懸浮液(350000 孢子/毫升)而對植物進行接種。在 23℃和 100%相對濕度培育 1 天後，被接種植物在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在塑膠罩之下及 23℃及 100%相對濕度中培育 3 天之後，植物被置於 23℃/20℃(日/夜)及 70%相對濕度之溫室中。在接種 11 至 12 天之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

大麥網斑病菌 (*Pyrenophora teres*) (*Helminthosporium teres*) /大麥/預防(大麥網斑病):1週大的大麥植物 cv. Regina 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥 2 天之後，藉由在試驗植物之上噴灑孢子懸浮液(2.6×10^4 分生孢子/毫升)而對大麥植物進行接種。在 20℃和 95%相對濕度下培育 4 天後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

小麥殼針孢 (*Septoria tritici*) /小麥/預防(小麥殼針葉斑)：2 週大的大麥植物 cv. Regina 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥 1 天之後，藉由在試驗植物之上噴灑孢子懸浮液(10^6 分生孢子/毫升)而對小麥植物進行接種。在 22°C/21°C 和 95%相對濕度下培育 1 天後，使植物於 22°C/21°C 和 70%相對濕度的溫室中保存。接種後 16 至 18 天之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

葡萄白粉病菌/葡萄/預防(葡萄上的白粉病菌)：5 週大的葡萄幼苗 cv. Gutedel 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥 1 天之後，藉由在試驗植物之上搖晃被葡萄白粉病菌感染的植物而對葡萄植物進行接種。在 24/22°C 和 70%相對濕度及在 14/10 小時(光/暗)之光方案下進行 7 天培育期之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

黑星菌/蘋果/預防(蘋果上的黑星菌)：3 週大的蘋果幼苗 cv. McIntosh 在噴灑室中被經調配的試驗化合物處理。在投藥 1 天之後，藉由在試驗植物之上噴灑孢子懸浮液(3.5×10^5 分生孢子/毫升)而對蘋果植物進行接種。在 20°C 和 95%相對濕度培育 4 天後，將植物置於 20°C/19°C 和 60%相對濕度之溫室中。接種 11 天之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

黑星菌/蘋果/治療(蘋果上的黑星菌)：在投藥 2 天之前，3 週大的蘋果幼苗 cv. McIntosh 藉由在試驗植物之噴灑孢子懸浮液(3.5×10^5 分生孢子/毫升)而對植物進行接種。在 20°C 和 95%相對濕度之下接種 2 天後，被接種植物在噴灑室

中被經調配的試驗化合物處理。蘋果植物被置於 20°C/19°C 及 60%相對濕度之溫室中。在接種 11 天之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

篩選方法土壤濕透(Soil Drench)應用

布氏白粉菌(*Blumeria(Erysiphe)graminis*)/小麥/土壤濕透(小麥上白粉黴菌(powdery mildew))：

包含 1 週大的小麥植物 cv. Arina 的每一盆(土壤體積：40 毫升)被倒入 4 毫升化合物溶液。投藥 4 天之後，藉由在接種室中將黴菌孢子散佈於試驗植物上而對小麥植物進行接種。在 20°C/18°C(日/夜)和 60%相對濕度的溫室中培育 6 天之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

晚疫病菌 (*Phytophthora infestans*) /番茄/土壤濕透(番茄上晚疫病菌)：

每一盆裝有 3 週大的番茄植物 cv. Roter Gnom (土壤體積：40 毫升)被倒入 4 毫升化合物溶液。投藥 4 天之後，藉由在接種室中將孢子懸浮液散佈於試驗植物上而對植物進行接種。在 18°C 和 100%相對濕度的溫室中培育 4 天之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

晚疫病菌 (*Phytophthora infestans*) /馬鈴薯/土壤濕透(馬鈴薯上晚疫病菌)：

每一盆裝有 2 週大的馬鈴薯植物 cv. Bintje (土壤體積：40 毫升)被倒入 4 毫升化合物溶液。投藥 4 天之後，藉由將孢子懸浮液噴灑於試驗植物上而對植物進行接種。在 18°C 和 100%相對濕度的溫室中培育 4 天之後，評估被疾病

覆蓋的葉子面積百分比。

霜黴病菌 (*Plasmopara viticola*) /馬鈴薯/土壤濕透(葡萄霜黴病)：

每一盆裝有 5 週大的葡萄植物 cv. Gutedel (土壤體積：40 毫升)被倒入 4 毫升化合物溶液。投藥 3 天之後，藉由將孢子懸浮液散噴灑於試驗植物上而對葡萄植物進行接種。在 22℃ 和 100%相對濕度的溫室中培育 6 天之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

小麥葉鏽菌 (*Puccinia recondita f.sp. tritici*) /小麥/土壤濕透(小麥褐銹病)：

每一盆裝有 1 週大的小麥植物 cv. Arina (土壤體積：40 毫升)被倒入 4 毫升化合物溶液。投藥 3 天之後，藉由將孢子懸浮液(1×10^5 夏孢子/毫升)噴灑於試驗植物上而對小麥植物進行接種。在 20℃ 和 95%相對濕度的溫室中培育 1 天之後，植物被置於 20℃/18℃(日/夜)及 60%相對濕度之溫室中，在接種 11 天之後評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

稻熱病菌(*Magnaporthe grisea*) (*Pyricularia oryzae*)/稻米/土壤濕透(稻米稻瘟病)：

每一盆裝有 3 週大的稻米植物 cv. Koshihikari (土壤體積：40 毫升)被倒入 4 毫升化合物溶液。投藥 4 天之後，藉由將孢子懸浮液(1×10^5 孢子/毫升)噴灑於試驗植物上而對稻米植物進行接種。在 25℃ 和 95%相對濕度培育 6 天之後，評估被疾病覆蓋的葉子面積百分比。

終極腐黴 (*Phythium ultimum*) /棉花/(棉苗猝倒病

(Damping-off on cotton)：定義數量的終極腐黴菌絲與先前經消毒土壤混合。在投與經調配之種子處理於棉花種子(cv. Sure Grow 747)之後，種子被種入被感染土壤內達 2 公分深。此試驗物於 18℃ 培育直到種苗確實出苗為止。從此時開始將試驗物保持於 22℃ 和 14 小時光照期間。藉由評估出苗和枯萎和死亡的植物數目加以評鑑。以下化合物對棉花種苗上的終極腐黴提供至少 15% 控制：15、38、50、59、61、76、131。

霜霉病菌 (*Plasmopara halstedii*) / 向日葵 (向日葵霜霉病)：在投與經調配之種子處理之後，向日葵種子被種入被感染土壤內達 1.5 公分深。此試驗物被保持於 22℃ 和 14 小時光照期間。經過 2 天後，以吸取器將霜霉病菌的孢子懸浮液 (1×10^5 游動孢子) 加入接近萌動種子的土壤表面。16 天之後，該試驗物在高濕度之下培育，2 天之後評估被感染植物的數目。

在葉盤檢定中以下面所述方法測試該等化合物。將測試化合物溶解於 DMSO 中且在水中稀釋為 200 ppm。測試終極腐黴 (*Pythium ultimum*) 時，將其溶解於 DMSO 中且在水中稀釋為 20 ppm。

小麥白粉菌 (*Erysiphe graminis f.sp. tritici*) (小麥白粉病)：將小麥葉片段置於 24 孔平板中之瓊脂上且噴灑測試化合物之溶液。使其在 12 與 24 小時之間完全乾燥後，對葉盤接種真菌之孢子懸浮液。適當培育後，接種後 4 天評估化合物之活性作為預防性殺真菌活性。

小麥葉鏽菌 (*Puccinia recondita f.sp. tritici*) (小麥褐銹病)：將小麥葉片段置於 24 孔平板中之瓊脂上且噴灑測試化合物之溶液。使其在 12 與 24 小時之間完全乾燥後，對葉盤接種真菌之孢子懸浮液。適當培育後，接種後 9 天評估化合物之活性作為預防性殺真菌活性。

穎枯殼針孢 (*Septoria nodorum*) (小麥穎枯病)：將小麥葉片段置於 24 孔平板中之瓊脂上且噴灑測試化合物之溶液。使其在 12 與 24 小時之間完全乾燥後，對葉盤接種真菌之孢子懸浮液。適當培育後，接種後 4 天評估化合物之活性作為預防性殺真菌活性。

大麥網斑病菌 (*Pyrenophora teres*) (大麥網斑病)：將大麥葉片段置於 24 孔平板中之瓊脂上且噴灑測試化合物之溶液。使其在 12 與 24 小時之間完全乾燥後，對葉盤接種真菌之孢子懸浮液。適當培育後，接種後 4 天評估化合物之活性作為預防性殺真菌活性。

稻梨孢 (*Pyricularia oryzae*) (稻瘟病)：將水稻葉片段置於 24 孔平板中之瓊脂上且噴灑測試化合物之溶液。使其在 12 與 24 小時之間完全乾燥後，對葉盤接種真菌之孢子懸浮液。適當培育後，接種後 4 天評估化合物之活性作為預防性殺真菌活性。

灰黴病菌 (*Botrytis cinerea*) (灰黴病)：將豆葉盤置於 24 孔平板中之瓊脂上且噴灑測試化合物之溶液。使其在 12 與 24 小時之間完全乾燥後，對葉盤接種真菌之孢子懸浮液。適當培育後，接種後 4 天評估化合物之活性作為預防

性殺真菌活性。

晚疫病菌 (*Phytophthora infestans*) (馬鈴薯或番茄晚疫病)：將番茄葉盤置於 24 孔平板中之水瓊脂上且噴灑測試化合物之溶液。使其在 12 與 24 小時之間完全乾燥後，對葉盤接種真菌之孢子懸浮液。適當培育後，接種後 4 天評估化合物之活性作為預防性殺真菌活性。

霜黴病菌 (*Plasmopara viticola*) (葡萄霜黴病)：將葡萄葉盤置於 24 孔平板中之瓊脂上且噴灑測試化合物之溶液。使其在 12 與 24 小時之間完全乾燥後，對葉盤接種真菌之孢子懸浮液。適當培育後，接種後 7 天評估化合物之活性作為預防性殺真菌活性。

小麥殼針孢 (*Septoria tritici*) (葉斑 (leaf blotch))：將深低溫儲存之真菌之分生孢子直接混合入營養肉湯 (PDB 馬鈴薯右旋糖肉湯) 中。將測試化合物之 (DMSO) 溶液置於微量滴定平板 (96 孔格式) 後，添加含有真菌孢子之營養肉湯。在 24°C 下培育測試平板且在 72 小時後光度測定對生長之抑制。

黃色鐮刀菌 (*Fusarium culmorum*) (根腐病)：將深低溫儲存之真菌之分生孢子直接混合入營養肉湯 (PDB 馬鈴薯右旋糖肉湯) 中。將測試化合物之 (DMSO) 溶液置於微量滴定平板 (96 孔格式) 後，添加含有真菌孢子之營養肉湯。在 24°C 下培育測試平板且在 48 小時後光度測定對生長之抑制。

終極腐黴 (*Phythium ultimum*) (猝倒病 (Damping

off)) : 將由新鮮液體培養物製備之真菌菌絲體片段混合入馬鈴薯右旋糖肉湯中。以水將測試化合物之二甲基亞砷溶液稀釋至 20 ppm，接著置於 96 孔微量滴定平板中，且添加含有真菌孢子之營養肉湯。在 24℃ 下培育測試平板且在 48 小時後光度測定對生長之抑制。

以下化合物（前面為化合物之編號，接著括號中為表編號）在 200 ppm 將以下真菌感染控制至少 60%：

葡萄霜黴病，化合物 1、2、3、4、5、8、13、14、15、17、18、19、23、28、29、31、32、33、36、37、38、40、41、42、44、45、46、47、49、50、51、52、53、54、55、56、57、58、59、61、62、63、64、65、66、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、78、79、80、81、82、83、84、89、90、91、92、93、94、95、96、98、99、101、106、108、109、111、112、113、114、115、116、117、118、119、120、121、122、125、126、127、130、131、134、135、138、139、140、141、142、143、144、145、146、147、148、151、152、153、154、155；

晚疫病菌，化合物 1、2、3、4、5、8、13、14、15、16、17、19、23、26、27、29、31、32、37、38、41、42、45、46、49、52、53、54、55、56、57、58、59、60、61、62、63、64、65、66、68、69、70、72、74、75、76、77、78、79、80、89、91、92、93、94、95、101、104、108、109、111、112、113、114、115、116、117、118、119、120、130、131、132、134、138、139、140、141、142、

143、144、145、146、147、148、150、151、152、153、
154、155；

小麥白粉菌，化合物 1、2、3、4、5、7、13、15、16、
17、19、23、26、29、31、32、36、37、38、41、44、45、
46、49、51、53、54、55、56、57、58、59、61、62、63、
64、65、66、68、69、70、71、72、73、74、75、76、77、
79、80、85、89、90、92、93、94、95、101、102、103、
104、105、108、114、115、117、118、119、120、130、
131、132、134、135、137、138、139、140、141、142、
143、144、145、146、147、148、149、151、152、153、
154、155；

灰黴病菌，化合物 1、13、33、39、40、55、56、58、
59、60、61、62、64、65、66、68、69、71、72、73、74、
75、76、81、83、84、85、87、89、90、91、95、96、97、
99、106、108、121、122、123、129、145、149；

稻梨孢，化合物 2、15、16、27、31、45、116、117、
118、119、120；

小麥葉鏽菌，化合物 5、32、55、56、57、59、61、62、
64、65、66、69、72、73、76、77、78、79、80、93、94、
95、111、117、118、119、120、134、135、138、139、141、
142、144、146、147、148、149、155；

穎枯殼針孢，化合物 2、5、17、23、26、29、34、38、
42、45、46、48、55、56、57、58、59、61、62、63、64、
65、66、68、69、72、73、75、76、77、78、79、80、93、

94、95、103、111、112、113、114、115、116、117、118、
119、120、124、130、131、132、134、135、138、139、
145、146、147、148、154、155；

小麥殼針孢，化合物 1、2、3、4、5、7、8、9、12、
13、15、17、18、19、22、24、25、26、27、28、30、33、
34、35、36、37、38、39、40、41、43、44、45、46、47、
48、49、50、51、53、54、56、57、58、59、60、61、62、
63、64、65、66、68、69、70、71、72、73、74、76、77、
78、79、80、81、82、83、84、85、89、90、92、93、94、
95、96、97、98、99、100、101、102、103、105、106、
108、109、110、111、116、117、118、119、120、121、
122、123、124、125、126、127、128、129、130、131、
132、133、134、135、136、137、138、139、140、141、
142、143、144、145、146、147、148、149、151、152、
153、154、155；

黃色鐮刀菌，化合物 2、23、26、29、31、32、48、52、
53、54、55、57、59、61、64、65、66、69、71、72、73、
76、77、78、79、80、93、94、95、105、111、112、113、
114、115、134、139、141、142、144、146、147、148、
149、153、155；

來自以上實施例之以下化合物在 20 ppm 將以下真菌感
染控制至少 60%：終極腐黴，1、4、8、12、13、14、15、
16、17、19、23、29、31、32、35、41、44、51、52、53、
54、55、56、57、58、60、61、62、64、65、66、69、70、

72、73、74、76、77、78、79、80、82、87、88、90、91、
92、94、95、96、101、102、105、108、111、112、113、
115、116、117、118、119、120、127、128、130、131、
132、134、135、138、139、140、141、142、143、146、
147、148、149、150、151、152、153。

【圖式簡單說明】

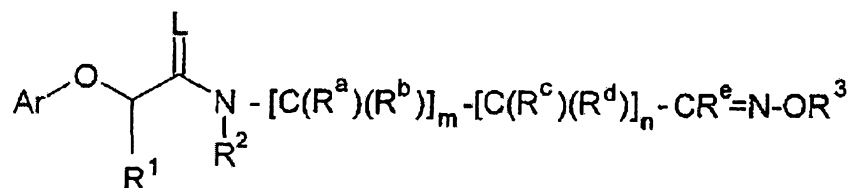
(無)

【主要元件符號說明】

(無)

五、中文發明摘要：

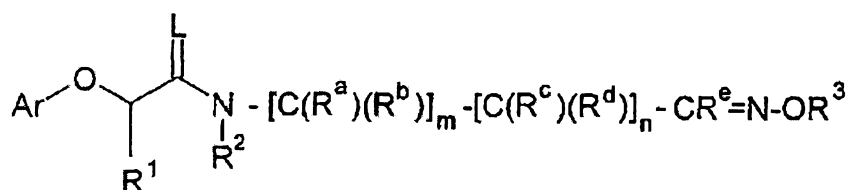
本發明提供以下通式之化合物：



其中取代基如申請專利範圍第 1 項所定義，其適用作為殺真菌劑。

六、英文發明摘要：

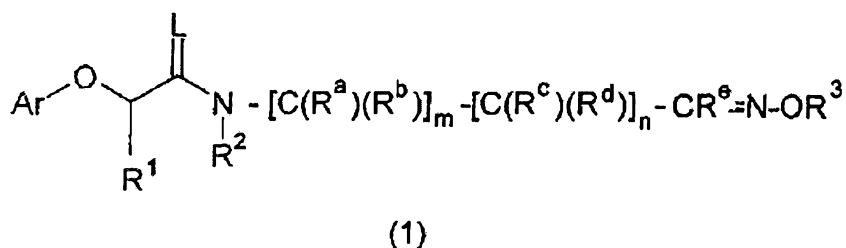
Compounds of the general formula



wherein the substituents are as defined in claim 1, are useful as fungicides.

十、申請專利範圍：

1. 一種通式(1)之化合物，



其中：

Ar 為視需要經取代之 8-至 14 員飽和或不飽和二-或三環式環，

L 為 O 或 S；

R^1 為 C_{1-4} 烷基、鹵 C_{1-4} 烷基或 C_{3-4} 環烷基，或 C_{1-4} 烷氧基、鹵 (C_{1-4}) 烷氧基或 C_{3-4} 環烷氧基，或 C_{1-4} 烷硫基， C_{1-4} 烷基亞磺基或 C_{1-4} 烷基磺基，或鹵 C_{1-4} 烷硫基，鹵 (C_{1-4}) 烷基亞磺基或鹵 (C_{1-4}) 烷基磺基，或 C_{3-4} 環烷硫基， C_{3-4} 環烷基亞磺基或 C_{3-4} 環烷基磺基；

R^2 為氫、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-4} 環烷基、 C_{2-8} 烯基、氰基 (C_{1-4}) 烷基、 C_{1-4} 烷氧基 (C_{1-4}) 烷基、 C_{1-4} 烷氧基 (C_{1-4}) 烷氧基 (C_{1-4}) 烷基或苄氧基 (C_{1-4}) 烷基，其中苄基部分之苯環視情況經 C_{1-4} 烷氧基取代；

R^a 與 R^b 彼此獨立地為氫、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 鹵烷基、 C_{1-4} 烷氧基 (C_{1-4}) 烷基、 C_{3-5} 烯氧基 (C_{1-4}) 烷基、 C_{3-5} 炔氧基 (C_{1-4}) 烷基、 C_{1-4} 羥烷基、氰基、 C_{2-4} 炔基、 C_{2-4} 烯基、 (C_{1-4}) 烷氧基羰基、甲磺基、 C_{1-3} 烷氧基 (C_{1-3}) 烷基 (C_{1-3}) 炔基、 C_{1-3} 烯氧基 (C_{1-3}) 烷基 (C_{1-3}) 炔基、 C_{1-3} 炔氧基 (C_{1-3})

烷基 (C_{1-3}) 炔基或羥基 (C_{1-3}) 烷基 (C_{1-3}) 炔基，

R^c 與 R^d 彼此獨立地為氫、 C_{1-4} 烷基、鹵素，氰基，羥基， C_{1-4} 烷氧基或 (C_{1-4}) 烷氧基羰基，或

R^a 與 R^b 或 R^c 與 R^d 一起與其所連接的碳形成 3 至 6 員碳環式或雜環式之環，其包含選自硫，氧，氮及 NR^O 之雜原子，其中 R^O 為氫或視需要經取代之 C_{1-4} 烷基，

R^e 為氫或 C_{1-4} 烷基、苯基，苄基，噻吩基甲基或吡啶基甲基，

R^3 為氫，視需要經取代之 C_{1-6} 烷基、視需要經取代之 C_{3-6} 環烷基，其視需要包含選自氧、硫或氮之雜原子，視需要經取代之 C_{2-4} 烯基，視需要經取代之 C_{2-6} 炔基， C_{1-4} 烷氧基 (C_{1-4}) 烷基， C_{3-5} 烯基氧基 (C_{1-4}) 烷基， C_{3-5} 炔基氧基 (C_{1-4}) 烷基，視需要經取代之芳基或視需要經取代之雜芳基，

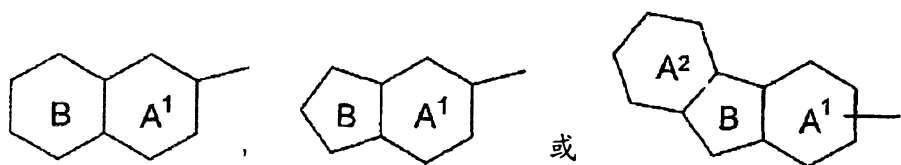
m 為 1 或 2，

n 為 0，1 或 2，以及

式(1)化合物之鹽及 N-氧化物，

其限制條件為當 Ar 為喹啉-6-基基團且 R^1 為 C_{1-4} 烷硫基， C_{1-4} 烷基亞磺醯基或 C_{1-4} 烷基磺醯基，或鹵 (C_{1-4}) 烷硫基，鹵 (C_{1-4}) 烷基亞磺醯基或鹵 (C_{1-4}) 烷基磺醯基，或 C_{3-4} 環烷硫基， C_{3-4} 環烷基亞磺醯基或 C_{3-4} 環烷基磺醯基，則喹啉-6-基之 7 位置未經取代。

2. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 Ar 為下式基



其中

A^1 為視需要經取代之苯基，

A^2 為視需要經取代之 6-員芳香族環，以及

B 為飽和、部分飽和或不飽和、視需要經取代之 5- 或 6-員環，其視需要包含選自硫，氧或 NR^0 之雜原子，其中 R^0 為氫或視需要經取代之 C_{1-4} 烷基。

3. 根據申請專利範圍第 2 項之化合物，其中 A^1 為視需要經 C_{1-4} 烷基或鹵素取代。

4. 根據申請專利範圍第 2 項之化合物，其中 A^2 為視需要經 C_{1-4} 烷基或鹵素取代。

5. 根據申請專利範圍第 2 項之化合物，其中 B 為視需要經 C_{1-4} 烷基、 C_{2-4} 烯基、 C_{2-4} 炔基或鹵素取代。

6. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R^1 為 C_{1-4} 烷基、鹵(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} -烷氧基、鹵(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基或鹵(C_{1-4})烷硫基。

7. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R^2 為氫， C_{1-8} 烷基， C_{3-4} 環烷基， C_{2-8} 烯基，氰基(C_{1-4})烷基， C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷基， C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷氧基(C_{1-4})烷基

8. 根據申請專利範圍第 1 項之化合物，其中 R^3 為氫，視需要經取代之 C_{1-4} 烷基，視需要經取代之 C_{3-6} 環烷基(其視需要包含氧原子)，視需要經取代之 C_{2-4} 烯基，視需要經

取代之 (C_{2-4}) 炔基或 C_{1-3} 烷氧基 (C_{1-3}) 烷基羰基。

9.根據申請專利範圍第1項之化合物，其中 R^e 為氫， m 為1， n 為1且 R^c 及 R^d 為氫。

10.根據申請專利範圍第1項之化合物，其中 m 為1且 n 為0。

11.根據申請專利範圍第1項之化合物，其中 R^e 為氫， m 為1且 n 為0。

12.根據申請專利範圍第1項之化合物，其中 R^a 為氫或甲基，且 R^b 為氫，甲基，氰基，乙炔基，甲氧基甲基，烯丙基甲基或炔丙基氧基甲基。

13.根據申請專利範圍第1項之化合物，其中 R^e 為氫， R^a 為氫或甲基且 R^b 為氫，甲基，氰基，乙炔基，甲氧基甲基，烯丙基氧基甲基或炔丙基氧基甲基。

14.一種製備如先前所述式(1)之化合物之方法。

15.一種殺真菌組成物，其包含殺真菌有效量之根據申請專利範圍第1項之式(1)化合物，及其適合的載體或稀釋劑，以及視需要的進一步殺真菌化合物。

16.一種對抗或控制植物病原體真菌之方法，其包含以殺真菌有效量之根據申請專利範圍第1項之式(1)化合物或根據申請專利範圍第15項之組成物施予植物、植物種子、植物或種子所在地或土壤或任何其它植物生長介質。

十一、圖式：

(無)

取代之 (C_{2-4}) 炔基或 C_{1-3} 烷氧基 (C_{1-3}) 烷基羰基。

9.根據申請專利範圍第1項之化合物，其中 R^e 為氫， m 為1， n 為1且 R^c 及 R^d 為氫。

10.根據申請專利範圍第1項之化合物，其中 m 為1且 n 為0。

11.根據申請專利範圍第1項之化合物，其中 R^e 為氫， m 為1且 n 為0。

12.根據申請專利範圍第1項之化合物，其中 R^a 為氫或甲基，且 R^b 為氫，甲基，氰基，乙炔基，甲氧基甲基，烯丙基甲基或炔丙基氧基甲基。

13.根據申請專利範圍第1項之化合物，其中 R^e 為氫， R^a 為氫或甲基且 R^b 為氫，甲基，氰基，乙炔基，甲氧基甲基，烯丙基氧基甲基或炔丙基氧基甲基。

14.一種製備如先前所述式(1)之化合物之方法。

15.一種殺真菌組成物，其包含殺真菌有效量之根據申請專利範圍第1項之式(1)化合物，及其適合的載體或稀釋劑，以及視需要的進一步殺真菌化合物。

16.一種對抗或控制植物病原體真菌之方法，其包含以殺真菌有效量之根據申請專利範圍第1項之式(1)化合物或根據申請專利範圍第15項之組成物施予植物、植物種子、植物或種子所在地或土壤或任何其它植物生長介質。

十一、圖式：

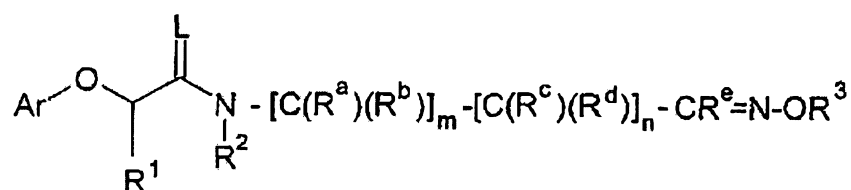
(無)

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第 (無) 圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

(無)

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

(1)