



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公告本

(11)證書號數：TW I459900 B

(45)公告日：中華民國 103 (2014) 年 11 月 11 日

(21)申請案號：099103471

(22)申請日：中華民國 99 (2010) 年 02 月 05 日

(51)Int. Cl. : A01N43/80 (2006.01)

A01N43/78 (2006.01)

A01N43/76 (2006.01)

(30)優先權：2009/02/06 日本

2009-025839

(71)申請人：住友化學股份有限公司 (日本) SUMITOMO CHEMICAL COMPANY, LIMITED (JP)

日本

(72)發明人：井原秀樹 IHARA, HIDEKI (JP)；隈本康司 KUMAMOTO, KOJI (JP)

(74)代理人：洪武雄；陳昭誠

(56)參考文獻：

WO 2008/126665A2

審查人員：林奕萍

申請專利範圍項數：11 項 圖式數：0 共 0 頁

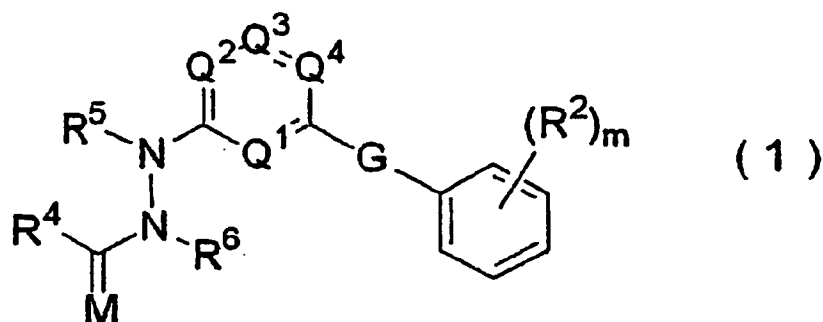
(54)名稱

肼化合物、其用途、有害生物防治組成物及防治有害生物的方法

HYDRAZIDE COMPOUND, ITS USE, PEST- CONTROLLING COMPOSITION, AND METHOD FOR CONTROLLING PEST

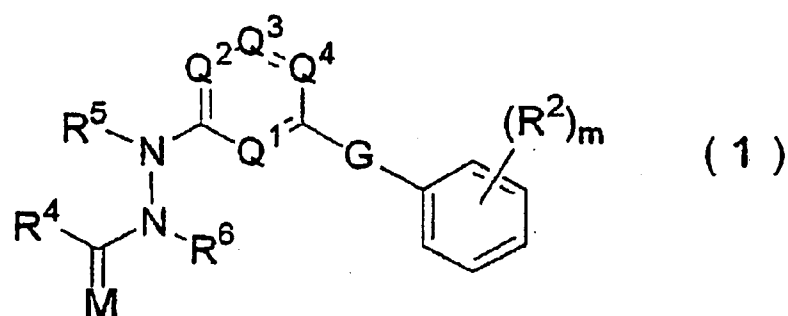
(57)摘要

本發明提供一種下式(1)表示之肼化合物，該化合物對有害生物具有防治效果：

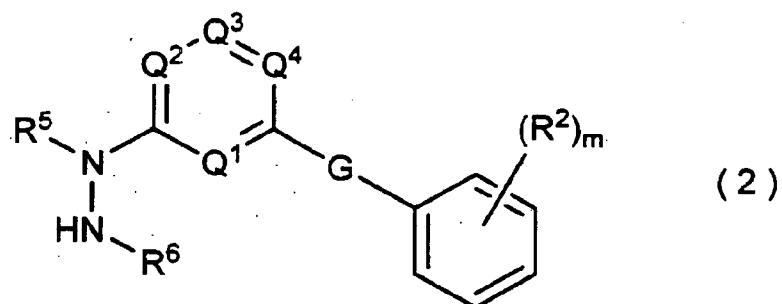
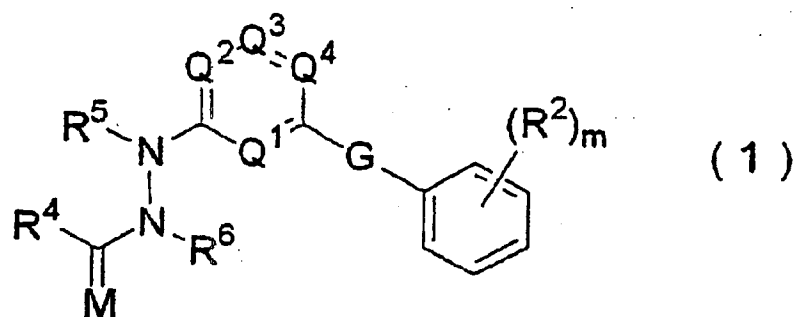


式中，G 為 5-員雜環基，M 為氧原子或硫原子，Q¹、Q²、Q³ 及 Q⁴ 獨立地為氮原子等，m 為 0 至 5 之整數，R² 為視需要經鹵化之 C1-C6 烷基等，R⁵ 及 R⁶ 獨立地為視需要經取代之 C1-C12 鏈烴基等，以及 R⁴ 為視需要經取代之 C1-C12 鏈烴基等。

There is provided a hydrazide compound having controlling effect on pests represented by the formula (1):



wherein, G is a 5-membered heterocyclic group, M is an oxygen atom or a sulfur atom, Q^1 , Q^2 , Q^3 and Q^4 is independently a nitrogen atom, etc., m is an integer of 0 to 5, R^2 is an optionally halogenated C1-C6 alkyl group, etc., R^5 and R^6 are independently an optionally substituted C1-C12 chain hydrocarbon group, etc., and R^4 is an optionally substituted C1-C12 chain hydrocarbon group, etc.



發明專利說明書

公告本

(本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號：99103471

A01N 43/80 (2006.01)

※ 申請日：99.02.05

※ IPC 分類：A01N 43/16 (2006.01)

A01N 43/78 (2006.01)

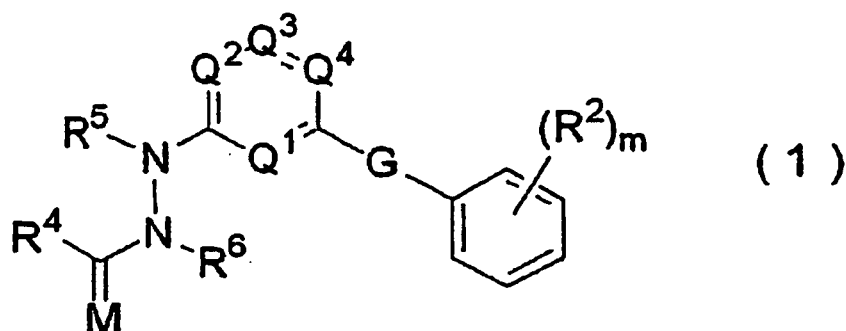
一、發明名稱：(中文/英文)

肼化合物、其用途、有害生物防治組成物及防治有害生物的方法

HYDRAZIDE COMPOUND, ITS USE, PEST-CONTROLLING COMPOSITION, AND METHOD FOR CONTROLLING PEST

二、中文發明摘要：

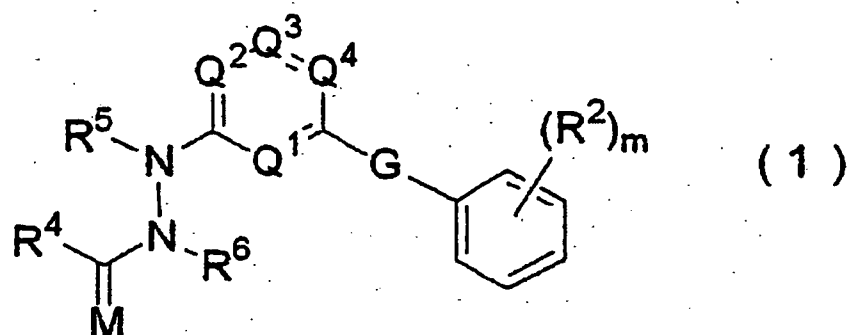
本發明提供一種下式(1)表示之肼化合物，該化合物對有害生物具有防治效果：



式中，G 為 5-員雜環基，M 為氧原子或硫原子，Q¹、Q²、Q³ 及 Q⁴ 獨立地為氮原子等，m 為 0 至 5 之整數，R² 為視需要經鹵化之 C1-C6 烷基等，R⁵ 及 R⁶ 獨立地為視需要經取代之 C1-C12 鏈烴基等，以及 R⁴ 為視需要經取代之 C1-C12 鏈烴基等。

三、英文發明摘要：

There is provided a hydrazide compound having controlling effect on pests represented by the formula (1):



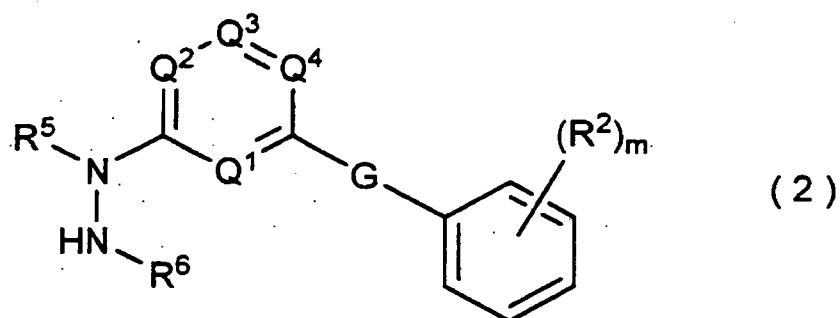
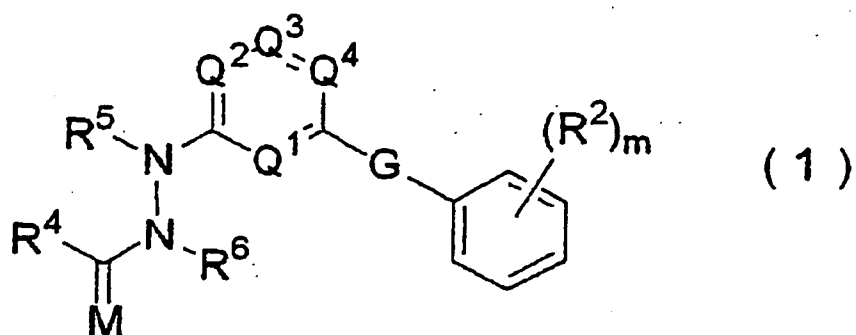
wherein, G is a 5-membered heterocyclic group, M is an oxygen atom or a sulfur atom, Q^1 , Q^2 , Q^3 and Q^4 is independently a nitrogen atom, etc., m is an integer of 0 to 5, R^2 is an optionally halogenated C1-C6 alkyl group, etc., R^5 and R^6 are independently an optionally substituted C1-C12 chain hydrocarbon group, etc., and R^4 is an optionally substituted C1-C12 chain hydrocarbon group, etc.

四、指定代表圖：本案無圖式

(一)本案指定代表圖為：第 () 圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於一種肼(hydrazide)化合物及其有害生物防治用途。

【先前技術】

迄今，已發現對於有害生物(pest)具有防治活性之化合物且已開發作為有害生物防治組成物之活性成分。

某些醯胺化合物已知作為有害生物防治組成物之活性成分(參照JP-A 2008-266293)。

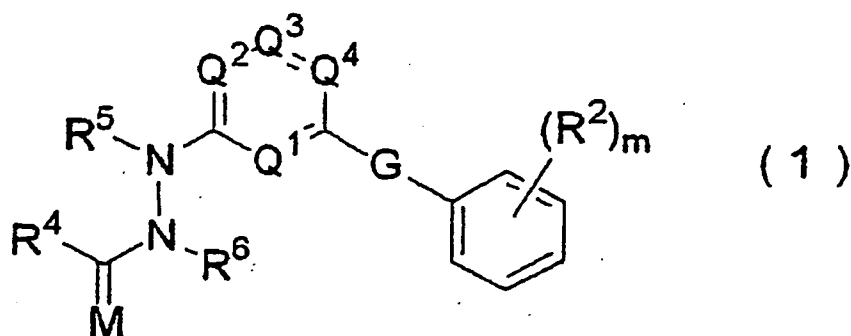
【發明內容】

本發明之目的係提供一種對有害生物具有防治活性之新穎化合物。

本案發明人積極研究以尋得一種對有害生物具有防治活性的化合物，其結果發現一種以下式(I)表示之肼化合物，對有害生物具有防治活性。因而完成本發明。

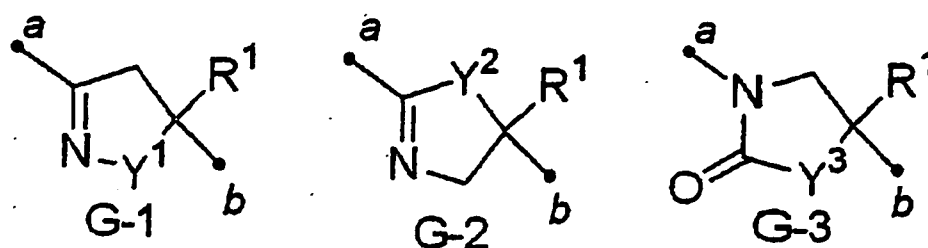
本發明提供：

[1]一種下式(1)表示之肼化合物(後文中稱為本發明化合物)：

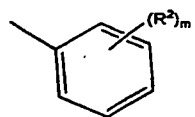


式中，

G 表示下式 G-1、G-2 或 G-3 所示之 5-員雜環基



其中， a 及 b 各表示鍵且 b 係連結至式



(1) 之 部分體 (moiety)，

R^1 表示 C1-C4 鹵烷基，

Y^1 表示氧原子、硫原子或 NR^7 基，

Y^2 表示氧原子、硫原子、 NR^7 基或亞甲基，

Y^3 表示氧原子、硫原子、 NR^7 基或亞甲基，

R^7 表示 C1-C6 烷基、C2-C6 烯基、C2-C6 炔基、C3-C6 環烷基、C4-C7 環烷基烷基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C2-C6 烷基胺基羰基、C3-C9 二烷基胺基羰基、苯基、氰基、甲醯基或氫原子，

M 表示氧原子或硫原子，

Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 獨立地表示氮原子或 CR^3 基，

R^3 表示視需要經鹵化之 C1-C6 烷基、視需要經鹵化之 C1-C6 烷氧基、硝基、氰基、鹵原子或氫原子，

m 表示 0 至 5 之整數，

R^2 表示視需要經鹵化之 C1-C6 烷基、視需要經鹵化之 C1-C6 烷氧基、C1-C6 烷基硫基、C1-C6 烷基亞磺醯基、C1-C6 烷基磺醯基、硝基、氰基或鹵原子，

限制條件為當 m 為 2 至 5 之整數時，該等 R^2 可彼此相同或不同，

R^5 及 R^6 獨立地表示視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基、視需要經選自 E2 群之基團取代之苯甲醯基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C3-C12 環烷基、甲醯基或氫原子，

R^4 表示視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基、視需要經選自 E2 群之基團取代之 C3-C12 環狀烴基、視需要經選自 E2 群之基團取代之 5-至 6-員雜環基、 OR^8 基、 $N(R^9)R^{10}$ 基或氫原子，

R^8 表示視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基、視需要經選自 E2 群之基團取代之 C3-C12 環狀烴基或視需要經選自 E2 群之基團取代之 5-至 6-員雜環基，

R^9 表示視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基或視需要經選自 E2 群之基團取代之 C3-C12 環狀烴基，

R^{10} 表示視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基或氫原子，或

R^9 及 R^{10} 於其末端結合以表示 C2-C9 烷二基，

E1 群係由視需要經選自 E2 群之基團取代之 C3-C12 環狀烴基、視需要經選自 E2 群之基團取代之 5-至 6-員雜環基、視需要經選自 E2 群之基團取代之苯氧基、視需要經選自 E2 群之基團取代之苯基胺基、C2-C6 烷

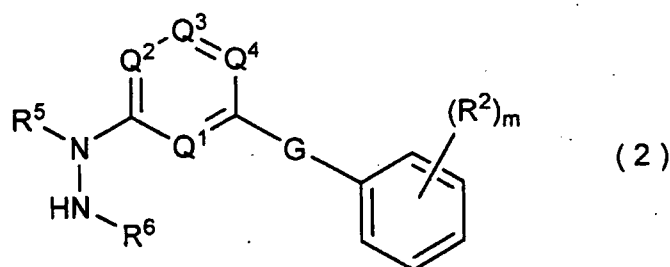
基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C1-C6 烷氧基、C1-C6 烷基胺基、C2-C12 二烷基胺基、硝基、氰基、甲醯基與鹵原子所成之組群，以及

E2群係由視需要經鹵化之C1-C6烷基、視需要經鹵化之C1-C6烷氧基、C2-C6烷基羰基、C2-C6烷氧基羰基、C1-C6烷基胺基、C2-C12二烷基胺基、硝基、氰基、甲醯基與鹵原子所成之組群；

[2] 一種有害生物防治組成物，包括[1]之肼化合物作為活性成分；

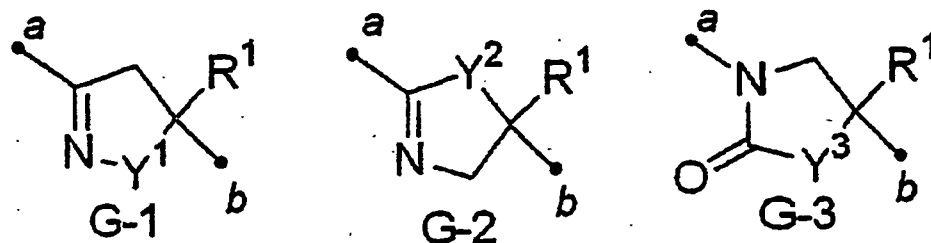
[3] 一種有害生物防治方法，其包括對有害生物或有害生物之棲息地施用有效量之[1]之肼化合物；以及

[4] 一種下式(2)表示之肼(hydrazine)化合物：

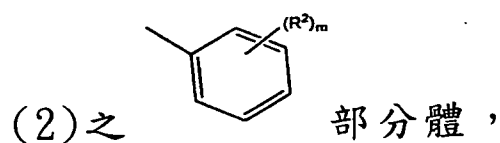


式中，

G 表示下式 G-1、G-2 或 G-3 所示之 5-員雜環基



其中，a — 及 b — 各表示鍵且 b — 係連結至式



R^1 表示 C1-C4 鹵烷基，

Y^1 表示氧原子、硫原子或 NR^7 基，

Y^2 表示氧原子、硫原子、 NR^7 基或亞甲基，

Y^3 表示氧原子、硫原子、 NR^7 基或亞甲基，

R^7 表示 C1-C6 烷基、C2-C6 烯基、C2-C6 炔基、C3-C6 環烷基、C4-C7 環烷基烷基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C2-C6 烷基胺基羰基、C3-C9 二烷基胺基羰基、苯基、氰基、甲醯基或氫原子，

Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 獨立地表示氮原子或 CR^3 基，

R^3 表示視需要經鹵化之 C1-C6 烷基、視需要經鹵化之 C1-C6 烷氧基、硝基、氰基、鹵原子或氫原子，

m 表示 0 至 5 之整數，

R^2 表示視需要經鹵化之 C1-C6 烷基、視需要經鹵化之 C1-C6 烷氧基、C1-C6 烷基硫基、C1-C6 烷基亞磺醯基、C1-C6 烷基磺醯基、硝基、氰基或鹵原子，

限制條件為當 m 為 2 至 5 之整數時，該等 R^2 可彼此相同或不同，

R^5 及 R^6 獨立地表示視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基、視需要經選自 E2 群之基團取代之苯甲醯基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C3-C12 環烷基、甲醯基或氫原子，

E1 群係由視需要經選自 E2 群之基團取代之 C3-C12

環狀烴基、視需要經選自 E2 群之基團取代之 5-至 6-員雜環基、視需要經選自 E2 群之基團取代之苯氧基、視需要經選自 E2 群之基團取代之苯基胺基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C1-C6 烷氧基、C1-C6 烷基胺基、C2-C12 二烷基胺基、硝基、氰基、甲醯基與鹵原子所成之組群，以及

E2 群係由視需要經鹵化之 C1-C6 烷基、視需要經鹵化之 C1-C6 烷氧基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C1-C6 烷基胺基、C2-C12 二烷基胺基、硝基、氰基、甲醯基與鹵原子所成之組群。

本發明之化合物對有害生物具有防治活性且因此有用於作為有害生物防治組成物之活性成分。

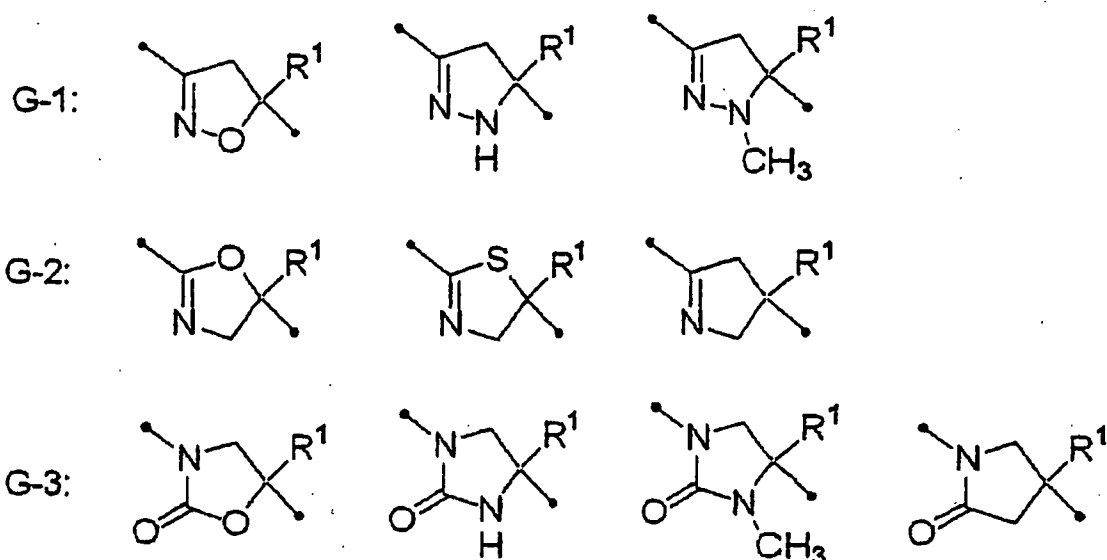
【實施方式】

如使用於本文，鹵原子意指氟原子、氯原子、溴原子或碘原子。

如使用於本文，例如，「C2-C6 烷基胺基羰基」之用語「C2-C6」意指組成烷基胺基羰基之碳原子總數係於 2 至 6 的範圍。

如使用於本文，各取代基之實例如下所示。

式子 G-1、G-2 或 G-3 所示之 5-員雜環基之實例包含下述 5-員雜環基。



如使用於本文，「C1-C4 鹵烷基」之實例包含氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、溴氟甲基、氯二氟甲基、溴二氟甲基、1-氟乙基、1,1-二氟乙基、1,1,2,2,2-五氟乙基、1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基及1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基。

「C1-C6 烷基」之實例包含甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、1-乙基丙基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、2,2-二甲基丙基、己基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、1,1-二甲基丁基及1,3-二甲基丁基。

「C2-C6 烯基」之實例包含乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基及5-己烯基。

「C2-C6 炔基」之實例包含乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔

基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基及5-己炔基。

「C3-C6 環烷基」之實例包含環丙基、1-甲基環丙基、2-甲基環丙基、2,2-二甲基環丙基、環丁基、環戊基、1-甲基環戊基、2-甲基環戊基、3-甲基環戊基及環己基。

「C4-C7 環烷基烷基」之實例包含環丙基甲基、1-環丙基乙基、2-環丙基乙基、環丁基甲基、環戊基甲基及環己基甲基。

「C2-C6 烷基羰基」之實例包含乙醯基、丙醯基、丁醯基、異丁醯基及三甲基乙醯基。

「C2-C6 烷氧基羰基」之實例包含甲氧基羰基、乙氧基羰基、異丙氧基羰基、丁氧基羰基、第三丁氧基羰基及戊氧基羰基。

「C2-C6 烷基胺基羰基」之實例包含 N-甲基胺基羰基、N-乙基胺基羰基、N-丙基胺基羰基、N-丁基胺基羰基及 N-戊基胺基羰基。

「C3-C9 二烷基胺基羰基」之實例包含 N,N-二甲基胺基羰基及 N,N-二乙基胺基羰基。

「C1-C6 烷氧基」之實例包含甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、丁氧基、異丁氧基、第二丁氧基、第三丁氧基、戊氧基及己氧基。

「視需要經鹵化之 C1-C6 烷基」之實例包含 C1-C6 烷基，例如甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、異丁基、第

二丁基、第三丁基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、1-乙基丙基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、2,2-二甲基丙基、己基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、1,1-二甲基丁基及1,3-二甲基丁基；以及

C1-C6 鹵烷基，例如氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、溴氟甲基、氯二氟甲基、溴二氟甲基、1-氟乙基、1,1-二氟乙基、1,1,2,2,2-五氟乙基、1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基及1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基。

「視需要經鹵化之 C1-C6 烷氧基」之實例包含 C1-C6 烷氧基，例如甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、丁氧基、異丁氧基、第二丁氧基、第三丁氧基、戊氧基及己氧基；以及 C1-C6 鹵烷氧基，例如二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯二氟甲氧基、溴二氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、1,1,2,2-四氟乙氧基、2-氯-1,1,2-三氟乙氧基、2-溴-1,1,2-三氟乙氧基、1,1,2,2,2-五氟乙氧基、2,2-二氯-1,1,2-三氟乙氧基、2,2,2-三氯-1,1-二氟乙氧基、2-溴-1,1,2,2-四氟乙氧基、2,2,3,3-四氟丙氧基、1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基、2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙氧基、1,1,2,2,3,3,3-七氟丙氧基及2-溴-1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基。

「C1-C6 烷基硫基」之實例包含甲基硫基、乙基硫基、丙基硫基、異丙基硫基、丁基硫基、戊基硫基及己基硫基。

「C1-C6 烷基亞磺醯基」之實例包含甲亞磺醯基、乙基

亞磺醯基、丙基亞磺醯基、異丙基亞磺醯基、丁基亞磺醯基、戊基亞磺醯基及己基亞磺醯基。

「C1-C6 烷基磺醯基」之實例包含甲磺醯基、乙基磺醯基、丙基磺醯基、異丙基磺醯基、丁基磺醯基、戊基磺醯基及己基磺醯基。

「C3-C12 環烷基」之實例包含環丙基、1-甲基環丙基、2-甲基環丙基、2,2-二甲基環丙基、2,2,3,3-四甲基環丙基、環丁基、環戊基、1-甲基環戊基、2-甲基環戊基、3-甲基環戊基、環己基、1-甲基環己基、2-甲基環己基、3-甲基環己基、4-甲基環己基、環庚基及環辛基。

「C2-C9 烷二基」之實例包含 1,2-伸乙基、1,4-伸丁基 (1,4-tetramethylene)、1,5-伸戊基 (1,5-pentamethylene)。

如使用於本文之 C1-C12 鏈烴基之實例包含 C1-C12 烷基、C2-C12 烯基及 C2-C12 炔基。

「視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基」之實例包含 C1-C12 烷基，例如甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、1-乙基丙基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、2,2-二甲基丙基、己基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、庚基、辛基、壬基、癸基、十一基及十二基；

C2-C12 烯基，例如乙烯基、1-甲基乙烯基、1-苯基乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、2-丁烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-

甲基-2-丙烯基、2-戊烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、2-乙基-2-丙烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、2-己烯基、2-甲基-2-戊烯基、2,4-二甲基-2,6-庚二烯基及3,7-二甲基-2,6-辛二烯基；

C2-C12 炔基，例如 2-丙炔基、2-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基及 2-己炔基；

C1-C12 鹵烷基，例如 氟甲基、氯甲基、溴甲基、碘甲基、二氟甲基、氯氟甲基、二氯甲基、溴氯甲基、三氟甲基、氯二氟甲基、二氯氟甲基、三氯甲基、溴二氟甲基、溴氯氟甲基、二氟碘甲基、2-氟乙基、2-氯乙基、2-溴乙基、2,2-二氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2,2-二氯乙基、2-溴-2-氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、2-溴-2,2-二氟乙基、1,1,2,2-四氟乙基、1,1,2,2,2-五氟乙基、1-氯-1,2,2,2-四氟乙基、2-氯-1,1,2,2-四氟乙基、1,2-二氯-1,2,2,2-三氟乙基、1-溴-1,2,2,2-四氟乙基、2-溴-1,1,2,2-四氟乙基、2-氟丙基、2-氯丙基、2,3-二氯丙基、3,3,3-三氟丙基、3-溴-3,3-二氟丙基、2,2,3,3-四氟丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、1,1,2,3,3,3-六氟丙基、1,1,2,2,3,3,3-七氟丙基、2,3-二氯-1,1,2,3,3-五氟丙基、2-氟-1-甲基乙基、2-氯-1-甲基乙基、2-溴-1-甲基乙基、2,2,2-三氟-1-(三氟甲基)乙基、1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基及1,1,2,2,3,3,4,4,4-九氟丁基；

C2-C12 鹵烯基，例如 2,2-二氟乙烯基、2,2-二氯乙烯基、2-氟-2-丙烯基、2-氯-2-丙烯基、3-氯-2-丙烯基、2-溴-2-丙烯基、3-溴-2-丙烯基、3,3-二氟-2-丙烯基、2,3-二氯-2-丙烯基、3,3-二氯-2-丙烯基、2,3-二溴-2-丙烯基、2,3,3-三氟-2-丙烯基、2,3,3-三氯-2-丙烯基、3-氯-2-丁烯基、3-溴-2-丁烯基、4,4-二氟-3-丁烯基、3,4,4-三氟-3-丁烯基、3-氯-3,4,4-三氟-2-丁烯基及 3-溴-2-甲基-2-丙烯基；

C2-C12 鹵炔基，例如 3-氯-2-丙炔基、3-溴-2-丙炔基及 3-碘-2-丙炔基；

氰基(C1-C12 烷基)例如氰基甲基；

C1-C12 硝基烷基例如硝基甲基；

(C2-C12 二烷基胺基) C1-C12 烷基例如 N,N-二甲基胺基甲基；

(C1-C6 烷基胺基)C1-C12 烷基例如 N-乙基胺基甲基；

(C1-C6 烷氧基)C1-C12 烷基，例如甲氧基甲基、2-甲氧基乙基、2-乙氧基乙基、2-丙氧基乙基、2-異丙氧基乙基、2-丁氧基乙基、2-異丁氧基乙基、2-(1-甲基丙基氧基)乙基及 2-(1,1-二甲基乙氧基)乙基；

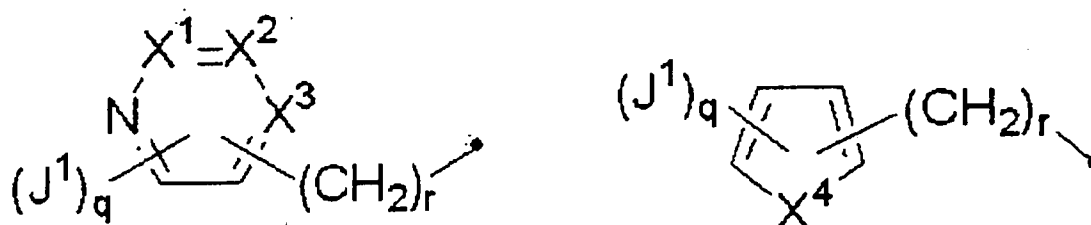
(C2-C6 烷氧基羰基)C1-C12 烷基，例如甲氧基羰基甲基、乙氧基羰基甲基、丙氧基羰基甲基、異丙氧基羰基甲基及第三丁氧基羰基甲基；

(C2-C6 烷基羰基)C1-C12 烷基，例如乙醯基甲基及 2-乙醯基乙基；

經以視需要經選自 E2 群之基團取代之苯氧基所取代之 C1-C12 烷基，例如苯氧基甲基、4-氯苯氧基甲基及苯氧基乙基；

經以視需要經選自 E2 群之基團取代之苯基胺基所取代之 C1-C12 烷基，例如苯基胺基甲基、4-氯苯基胺基甲基及苯基胺基乙基；

經以視需要經選自 E2 群之基團取代之 5-至 6-員雜環基所取代之 C1-C12 烷基，例如下式所示基團：



其中，全部之 X^1 、 X^2 及 X^3 表示 CH 基，或 X^1 、 X^2 及 X^3 之一者表示氮原子且另二者表示 CH 基； X^4 表示氧原子、硫原子或 NH 基； r 表示 1 至 12 之整數； q 表示 0 至 3 之整數； J^1 表示視需要經鹵化之 C1-C6 烷基、視需要經鹵化之 C1-C6 烷氧基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C1-C6 烷基胺基、C2-C12 二烷基胺基、硝基、氰基、甲醯基或鹵原子；以及經以視需要經選自 E2 群之基團取代之 C3-C12 環狀烴基所取代之 C1-C12 烷基，例如苯甲基、苯乙基、4-甲基苯甲基、4-氯苯甲基、2-(環丙基)乙基及環丙基甲基。

「視需要經選自 E2 群之基團取代之苯甲醯基」之實例包含苯甲醯基、2-氟苯甲醯基、3-氟苯甲醯基、4-氟苯甲醯基、2-氯苯甲醯基、3-氯苯甲醯基、4-氯苯甲醯基、2-甲氧基

苯甲醯基、3-甲氧基苯甲醯基、4-甲氧基苯甲醯基、2-氟基苯甲醯基、3-氟基苯甲醯基、4-氟基苯甲醯基、2-硝基苯甲醯基、3-硝基苯甲醯基及 4-硝基苯甲醯基。

如使用於本文之 C3-C12 環狀烴基之實例包含苯基、萘基及 C3-C12 環烷基。

「視需要經選自 E2 群之基團取代之 C3-C12 環狀烴基」之實例包含苯基；

烷基苯基，例如 2-甲基苯基、3-甲基苯基及 4-甲基苯基；

(鹵烷基)苯基，例如 2-(三氟甲基)苯基、3-(三氟甲基)苯基、4-(三氟甲基)苯基及 3,5-雙(三氟甲基)苯基；

鹵化苯基，例如 2-氟苯基、3-氟苯基、4-氟苯基、2-氯苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、2-溴苯基、3-溴苯基、4-溴苯基、2-碘苯基、3-碘苯基、4-碘苯基、2,6-二氯苯基、3,4-二氯苯基、3,5-二氯苯基、2,3,4-三氯苯基、2,3,5-三氯苯基、3,4,5-三氯苯基、2,4,6-三氯苯基、2,3-二氟苯基、2,4-二氟苯基、2,5-二氟苯基、2,6-二氟苯基、3,4-二氟苯基、3,5-二氟苯基、3,4,5-三氟苯基、2,3,5,6-四氟苯基、2,3,4,5,6-五氟苯基、2,3-二氯苯基、2,4-二氯苯基及 2,5-二氯苯基；

氟基苯基，例如 2-氟基苯基、3-氟基苯基及 4-氟基苯基；

硝基苯基例如 2-硝基苯基、3-硝基苯基及 4-硝基苯基；

烷氧基苯基例如 2-甲氧基苯基、3-甲氧基苯基、4-甲氧基苯基、2,3-二甲氧基苯基、2,4-二甲氧基苯基、2,5-二甲氧基苯基、2,6-二甲氧基苯基、3,4-二甲氧基苯基及 3,5-

二甲氧基苯基；

(鹵烷氧基)苯基例如 2-(三氟甲氧基)苯基、3-(三氟甲氧基)苯基及 4-(三氟甲氧基)苯基；

(烷氧基羰基)苯基，例如 4-甲氧基羰基苯基及 4-乙氧基羰基苯基；以及

C3-C12 環烷基，例如環丙基、1-甲基環丙基、2-甲基環丙基、2,2-二甲基環丙基、2,2,3,3-四甲基環丙基、環丁基、環戊基、1-甲基環戊基、2-甲基環戊基、3-甲基環戊基、環己基、1-甲基環己基、2-甲基環己基、3-甲基環己基、4-甲基環己基、環庚基及環辛基。

如使用於本文之 5-至 6-員雜環基之實例包含具有氧原子、硫原子及/或氮原子之 5-員雜環基，例如四氫呋喃基、呋喃基、噻吩基、吡咯基、咪唑基及異噻唑基；以及具有氧原子、硫原子及/或氮原子之 6-員雜環基，例如 N-六氫吡啶基、N-嗎啉基、吡啶基、嗒吡基、嘧啶基及吡嗪基。

「視需要經選自 E2 群之基團取代之 5-至 6-員雜環基」之實例包含 1-吡咯基、2-吡咯基、3-吡咯基、2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、1-吡唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、3-異噁唑基、4-異噁唑基或 5-異噁唑基、3-異噻唑基、4-異噻唑基、5-異噻唑基、1-咪唑基、2-咪唑基、4-咪唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、1,2,4-三唑-1-基、1,2,4-三唑-3-基、

1, 3, 4-噁二唑-2-基、1, 3, 4-噻二唑-2-基、1, 2, 4-噁二唑-3-基、1, 2, 4-噁二唑-5-基、1, 2, 4-噻二唑-3-基、1, 2, 4-噻二唑-5-基、1-吡咯啉基、2-吡咯啉基、3-吡咯啉基、2-四氫呋喃基、3-四氫呋喃基、1-(N-六氫吡啶基)、1-(N-嗎啉基)、2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-嗒吡基、4-嗒吡基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、1, 2, 4-三吡-3-基、1, 2, 4-三吡-5-基、1, 2, 4-三吡-6-基及 1, 3, 5-三吡-2-基。

「C1-C6 烷基胺基」之實例包含 N-甲基胺基、N-乙基胺基、N-丙基胺基、N-丁基胺基及 N-戊基胺基。

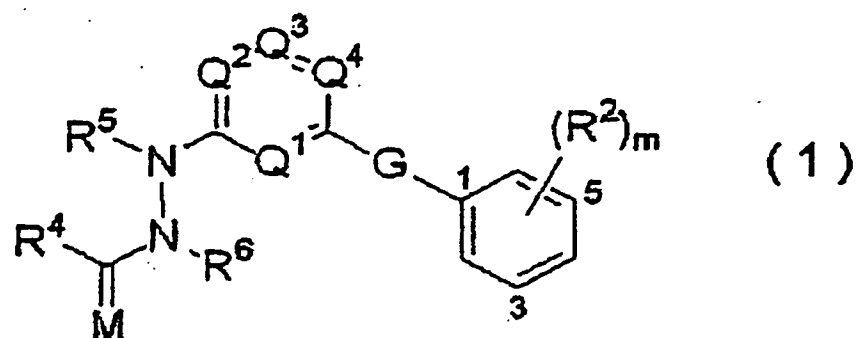
「C2-C12 二烷基胺基」之實例包含 N, N-二甲基胺基及 N, N-二乙基胺基。

OR⁸ 基之實例包含甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、丁氧基、異丁氧基、第二丁氧基、第三丁氧基、乙烯基氧基、烯丙基氧基、2, 2, 2-三氟乙氧基、氰基甲氧基、2-(N, N-二甲基胺基)乙氧基、2-(N-甲基胺基)乙氧基、甲氧基乙氧基、甲氧基羰基甲氧基、乙醯基甲氧基、苯氧基乙氧基、2-(苯基胺基)乙氧基、2-吡啶氧基、苯甲氧基、苯氧基、環己基氧基、呋喃-2-氧基及吡啶-2-氧基。

N(R⁹)R¹⁰ 基之實例包含 N-甲基胺基、N, N-二甲基胺基、N-乙基胺基、N, N-二乙基胺基、N-甲基-N-乙基胺基、N-烯丙基胺基、N-(2, 2, 2-三氟乙基)胺基、N-(2-(N, N-二甲基胺基)乙基)胺基、N-(2-(N-甲基胺基)乙基)胺基、N-(2-甲氧基乙基)胺基、N-(甲氧基羰基甲基)胺基、N-(2-

苯氧基乙基)胺基、N-(2-(苯基胺基)乙基)胺基、N-苯甲基胺基、N-苯基胺基、N-苯基-N-甲基胺基、N-環己基胺基、N-環己基-N-甲基胺基、吡咯啉-1-基及六氫吡啶-1-基。

本發明化合物之實例包含下述式(1)之胍化合物：



式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-2 表示之 5-員雜環。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-3 表示之 5-員雜環。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環且 Y¹ 為氧原子。

式(1)之胍化合物，其中 R¹ 為三氟甲基。

式(1)之胍化合物，其中 Q¹、Q²、Q³ 及 Q⁴ 為 CH 基。

式(1)之胍化合物，其中 Q¹、Q³ 及 Q⁴ 為 CH 基，Q² 為 CR³ 基且 R³ 係如上文所定義。

式(1)之胍化合物，其中 Q¹、Q³ 及 Q⁴ 為 CH 基，Q² 為 CR³ 基且 R³ 為 C1-C6 烷基。

式(1)之胍化合物，其中 Q¹、Q³ 及 Q⁴ 為 CH 基，Q² 為 CR³ 基且 R³ 為甲基。

式(1)之胍化合物，其中 Q¹、Q³ 及 Q⁴ 為 CH 基，Q² 為 CR³ 基且 R³ 為乙基。

式(1)之胍化合物，其中 Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基且 R^3 為鹵原子。

式(1)之胍化合物，其中 Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基且 R^3 為氟原子。

式(1)之胍化合物，其中 Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基且 R^3 為氯原子。

式(1)之胍化合物，其中 Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基且 R^3 為溴原子。

式(1)之胍化合物，其中 m 為 2 且該等 R^2 獨立為鹵原子。

式(1)之胍化合物，其中 m 為 2 且該等 R^2 為氯原子。

式(1)之胍化合物，其中 m 為 2，該等 R^2 係取代於 3- 及 5-位置之取代基且該等 R^2 為氯原子。

式(1)之胍化合物，其中 R^4 為視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基。

式(1)之胍化合物，其中 R^4 為視需要經選自 E2 群之基團取代之 C3-C12 環狀烴基。

式(1)之胍化合物，其中 R^4 為視需要經選自 E2 群之基團取代之 5-至 6-員雜環基。

式(1)之胍化合物，其中 R^4 為 OR^8 基且 R^8 係如上文所定義。

式(1)之胍化合物，其中 R^4 為 $N(R^9)R^{10}$ 基且 R^9 及 R^{10} 係如上文所定義。

式(1)之胍化合物，其中 R^5 為氫原子。

式(1)之胍化合物，其中 R^5 為視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基。

式(1)之胍化合物，其中 R^5 為甲基。

式(1)之胍化合物，其中 R^5 為 C2-C6 烷氧基羰基。

式(1)之胍化合物，其中 R^5 為 C2-C6 烷基羰基。

式(1)之胍化合物，其中 R^5 為乙醯基。

式(1)之胍化合物，其中 R^5 為視需要經選自 E2 群之基團取代之苯甲醯基。

式(1)之胍化合物，其中 R^5 為苯甲醯基。

式(1)之胍化合物，其中 R^6 為氫原子。

式(1)之胍化合物，其中 R^6 為視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基。

式(1)之胍化合物，其中 R^6 為甲基。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子且 R^1 為三氟甲基。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基且 Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基且該等 R^2 為氟原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2

為氯原子且 R^4 為視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^4 為視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基且 R^5 及 R^6 為氫原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^4 為視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基， R^5 為氫原子且 R^6 為甲基。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^4 為視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基， R^5 為甲基且 R^6 為氫原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^4 為視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基， R^5 為甲基且 R^6 為甲基。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2

為 CR^3 基且 R^3 係如上文所定義。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 係如上文所定義，m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基且該等 R^2 為氯原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為氯原子，m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基且該等 R^2 為氯原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為甲基，m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基且該等 R^2 為氯原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為乙基，m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基且該等 R^2 為氯原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為鹵原子，m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基且該等 R^2 為氯原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為氯原子，m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-

位置之取代基且該等 R^2 為氯原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為氯原子，m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基且該等 R^2 為氯原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為溴原子，m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基且該等 R^2 為氯原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 係如上文所定義，m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基， R^2 為氯原子且 R^4 為視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為氯原子，m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子且 R^5 及 R^6 為氫原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為氯原子，m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^5 為甲基且 R^6 為氫原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2

為 CR^3 基， R^3 為氯原子， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^5 為乙醯基且 R^6 為氫原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為氯原子， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^5 為苯甲醯基且 R^6 為氫原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為氯原子， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^4 為視需要經選自 E1 群之基團取代之 C3-C12 鏈烴基，且 R^5 及 R^6 為氫原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為氯原子， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^4 為視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 環狀烴基，且 R^5 及 R^6 為氫原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為氯原子， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^4 為視需要經選自 E2 群之基團取代之 5-至 6-員雜環基，且 R^5 及 R^6 為氫原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環

基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為氯原子， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^4 為 OR^8 ， R^8 係如上文所定義，且 R^5 及 R^6 為氫原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為氯原子， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^4 為 $N(R^9)R^{10}$ ， R^9 及 R^{10} 係如上文所定義，且 R^5 及 R^6 為氫原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為氯原子， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^4 為視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基， R^5 為甲基且 R^6 為氫原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為氯原子， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^4 為視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基， R^5 為乙醯基且 R^6 為氫原子。

式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^3 及 Q^4 為 CH 基， Q^2 為 CR^3 基， R^3 為氯原子， m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^4 為視需要經選自 E1

群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基， R^5 為苯甲醯基且 R^6 為氫原子。

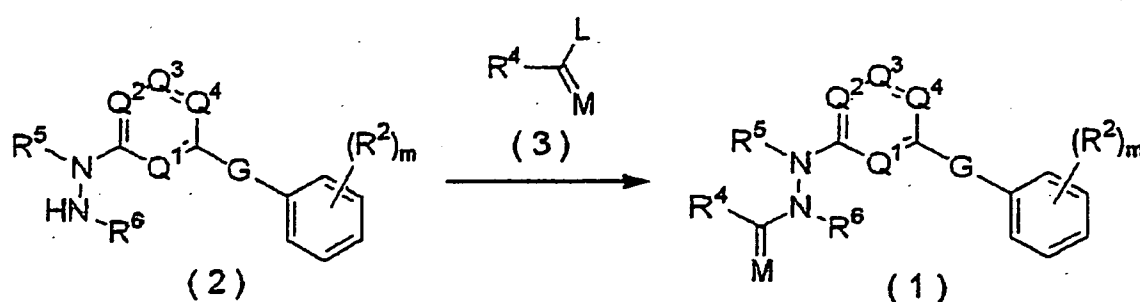
式(1)之胍化合物，其中 G 為式 G-1 表示之 5-員雜環基， Y^1 為氧原子，M 表示氧原子， R^1 為三氟甲基， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 分別為 CR^3 基， R^3 為 C1-C6 烷基或鹵原子，m 為 2，該等 R^2 係取代於 3-及 5-位置之取代基，該等 R^2 為氯原子， R^4 為 C1-C4 烷基、C1-C4 鹵烷基、C3-C6 環烷基、視需要經硝基或甲氧基取代之苯基、吡啶基、(C1-C4 烷氧基)甲基、(C1-C4 烷基)胺基、二(C1-C4 烷基)胺基、胺基、C2-C4 烯基、經苯基取代之乙烯基或氫原子， R^5 及 R^6 分別為 C1-C4 烷基、(C1-C4 烷氧基)羰基、烷基羰基、苯基羰基或氫原子。

接著，說明本發明之化合物之製備方法。

後文中，式(α)(α =任意符號)可稱為化合物(α)。

(製備方法1)

本發明之化合物可經由將化合物(2)與化合物(3)反應而製得：



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、G、M及m係如上文所定義且L表示羥基或氯原子。

反應通常在溶劑中進行。

溶劑之實例包含醚類，例如四氫呋喃、乙醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚及1,4-二噁烷；羧醯胺類(acid amides)，例如N,N-二甲基甲醯胺；腈類，例如乙腈；芳族烴類，例如甲苯及二甲苯；酯類，例如乙酸乙酯；亞砜類，例如二甲亞砜及環丁砜；鹵化烴類，例如1,2-二氯乙烷、氯仿及氯苯；及其混合物。

當L為氯原子時，反應通常在鹼存在下進行。

鹼之實例包含鹼金屬氫化物類，例如氫化鈉；碳酸鹽類，例如碳酸鉀；鹼金屬烷醇類，例如第三丁醇鉀；及有機胺類，例如三乙胺及吡啶。

當L為羥基時，反應通常於縮合劑存在下進行。

縮合劑之實例包含二環己基碳二亞胺及1-(3-二甲基胺基丙基)-3-乙基碳二亞胺鹽酸鹽。

用於反應之化合物(3)之量對於每1莫耳(mol)化合物(2)通常為1至10莫耳。

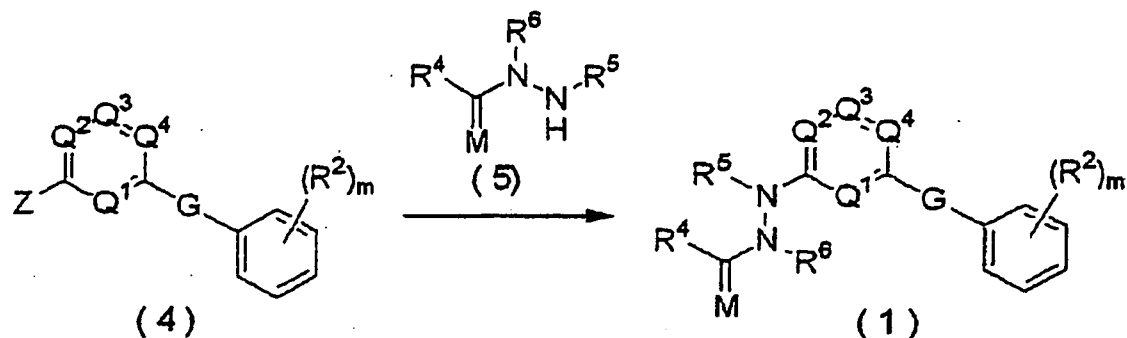
用於反應之鹼或縮合劑之量對於每1莫耳化合物(2)通常為1至10莫耳。

反應溫度通常為0至100°C的範圍，且反應時間通常為0.5至24小時的範圍。

反應完成後，本發明之化合物可經由後處理(post-treatment)而單離，例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。本發明之經單離之化合物可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

(製備方法 2)

本發明之化合物可經由將化合物(4)與化合物(5)反應而製得：



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 G 、 M 及 m 係如上文所定義，且 Z 表示脫離基，例如氟原子、氯原子、溴原子、碘原子、甲磺醯氧基、對甲苯磺醯氧基或三氟甲磺醯氧基。

反應通常在溶劑中進行。

溶劑之實例包含醚類，例如四氫呋喃、乙醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚及 1,4-二噁烷；羧醯胺類，例如 N,N -二甲基甲醯胺；腈類，例如乙腈；芳族烴類，例如甲苯及二甲苯；酯類，例如乙酸乙酯；亞砜類，例如二甲亞砜及環丁砜；鹵化烴類，例如 1,2-二氯乙烷、氯仿及氯苯；及其混合物。

若有需要，反應可於鹼存在下進行。

鹼之實例包含鹼金屬氫化物類，例如氫化鈉；碳酸鹽類，例如碳酸鉀；鹼金屬醇類，例如第三丁醇鉀；及有機胺類，例如三乙胺及吡啶。

用於反應之化合物(5)之量對於每 1 莫耳化合物(4)通常為 1 至 5 莫耳。所使用之鹼之用量對於每 1 莫耳化合物

(4)通常為 1 至 5 莫耳。

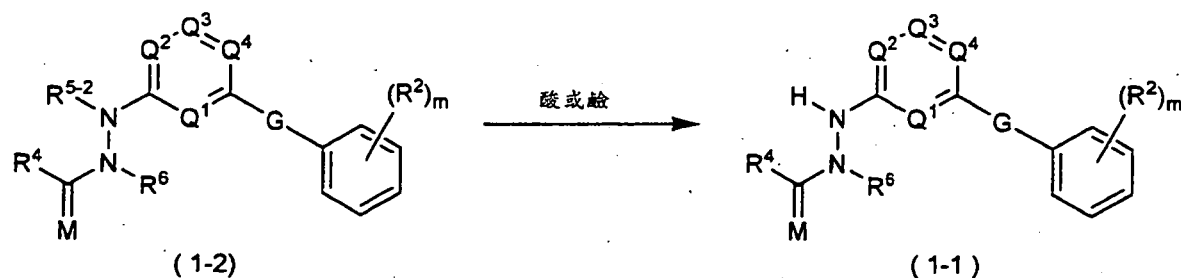
反應溫度通常為 0 至 100°C 的範圍，且反應時間通常為 0.1 至 24 小時的範圍。

反應完成後，本發明之化合物可經由後處理而單離，例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。本發明之經單離之化合物可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

反應亦可使用過渡金屬催化劑於一般偶合反應的條件下進行，如文獻所揭示者，例如 Org. Lett., 3, 3803-3805(2001)。

(製備方法 3)

本發明之化合物中，其中 R^5 為氫原子之化合物(1-1)，可經由將化合物(1-2)與酸或鹼反應而製得：



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^4 、 R^6 、 G 、 M 及 m 係如上文所定義，且 R^{5-2} 表示視需要經選自 E2 群之基團取代之苯甲醯基、C2-C6 烷基羰基或 C2-C6 烷氧基羰基。

若有需要，反應可在溶劑中進行。

溶劑之實例包含水；醚類，例如四氫呋喃、乙醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚及 1,4-二噁烷；羧醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺；腈類，例如乙腈；芳族烴類，

例如甲苯及二甲苯；酯類，例如乙酸乙酯；亞砜類，例如二甲亞砜及環丁砜；鹵化烴類，例如1,2-二氯乙烷、氯仿及氯苯；醇類，例如甲醇、乙醇及正丙醇；及其混合物。

酸之實例包含有機酸，例如乙酸及三氟乙酸；及無機酸，例如氫氯酸、氫溴酸及硫酸。

鹼之實例包含鹼金屬氫化物類，例如氫化鈉；碳酸鹽類，例如碳酸鉀；鹼金屬烷醇類，例如第三丁醇鉀；及有機胺類，例如三乙胺及吡啶。

用於反應之酸之量對於每1莫耳化合物(1-2)通常為1至100莫耳。

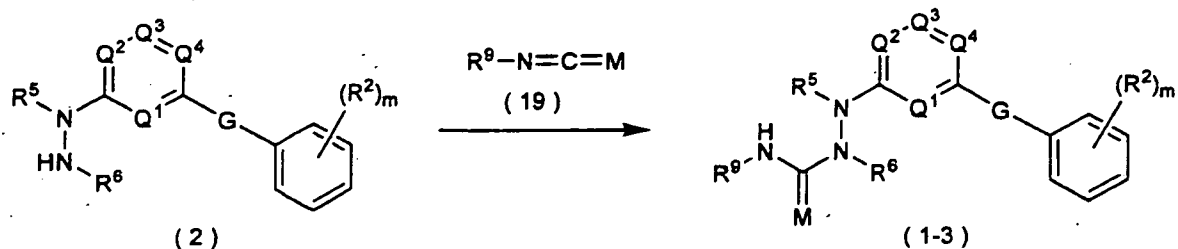
用於反應之鹼之量對於每1莫耳化合物(1-2)通常為1至100莫耳。

反應溫度通常為0至100°C的範圍，且反應時間通常為0.1至24小時的範圍。

反應完成後，本發明之化合物可經由後處理而單離，例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。本發明之經單離之化合物可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

(製備方法4)

本發明之化合物中，其中 R^4 為 $N(R^9)R^{10}$ 且 R^{10} 為氫原子之化合物(1-3)，可經由將化合物(2)與化合物(19)反應而製得：



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^5 、 R^6 、 G 、 M 及 m 係如上文所定義。

反應通常在溶劑中進行。若有需要，反應可於鹼存在下進行。

溶劑之實例包含醚類，例如四氫呋喃、乙醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚及1,4-二噁烷；羧醯胺類，例如 N,N -二甲基甲醯胺；腈類，例如乙腈；芳族烴類，例如甲苯及二甲苯；酯類，例如乙酸乙酯；亞砜類，例如二甲亞砜及環丁砜；鹵化烴類，例如1,2-二氯乙烷、氯仿及氯苯；及其混合物。

鹼之實例包含碳酸鹽類，例如碳酸鉀；及有機胺類，例如三乙胺、吡啶、4-(二甲基胺基)吡啶、咪唑及1,8-二氮雜雙環[5,4,0]-7-十一烯。

化合物(19)之用量對於每1莫耳化合物(2)通常為1至5莫耳。

若於反應中使用鹼，鹼之用量對於每1莫耳化合物(2)通常為1至5莫耳。

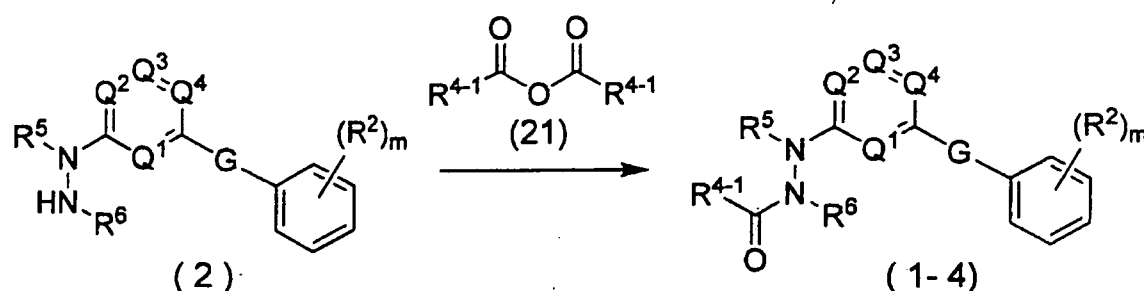
反應溫度通常為0至100°C的範圍，且反應時間通常為0.1至24小時的範圍。

反應完成後，本發明之化合物可經由後處理而單離，

例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。本發明之經單離之化合物可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

(製備方法 5)

本發明之化合物中，其中 R^4 為 R^{4-1} 且 M 為氧原子之化合物(1-4)，可經由將化合物(2)與化合物(21)反應而製得：



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^5 、 R^6 、G 及 m 係如上文所定義，以及 R^{4-1} 表示視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基、視需要經選自 E2 群之基團取代之 C3-C12 環狀烴基、視需要經選自 E2 群之基團取代之 5-至 6-員雜環基或 OR^8 且 R^8 係如上文所定義。

若有需要，反應通常在溶劑中進行。

溶劑之實例包含醚類，例如四氫呋喃、乙醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚及 1,4-二噁烷；羧醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺；腈類，例如乙腈；芳族烴類，例如甲苯及二甲苯；酯類，例如乙酸乙酯；亞砜類，例如二甲亞砜及環丁砜；鹵化烴類，例如 1,2-二氯乙烷、氯仿及氯苯；及其混合物。

若有需要，反應亦可於鹼存在下進行。

鹼之實例包含鹼金屬氫化物類，例如氫化鈉；碳酸鹽類，例如碳酸鉀；鹼金屬烷醇類，例如第三丁醇鉀；及有機胺類，例如三乙胺、吡啶、4-(二甲基胺基)吡啶及咪唑。

化合物(21)之用量對於每 1 莫耳化合物(2)通常為 1 至 10 莫耳。

若於反應中使用鹼，鹼之用量對於每 1 莫耳化合物(2)通常為 1 至 10 莫耳。

反應溫度通常為 0 至 100°C 的範圍，且反應時間通常為 0.1 至 24 小時的範圍。

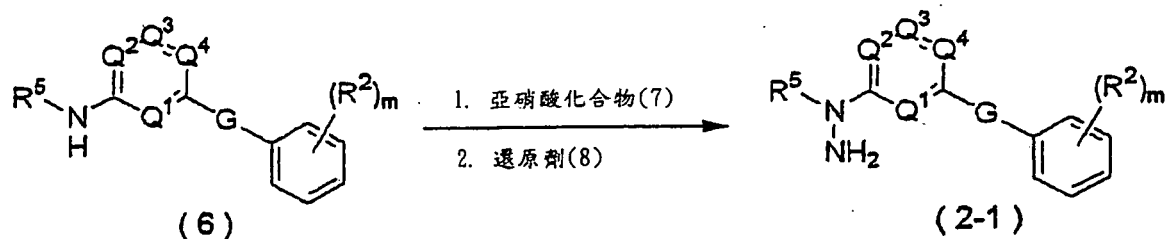
反應完成後，本發明之化合物可經由後處理而單離，例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。本發明之經單離之化合物可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

如上所述，式(2)所示之化合物有用於作為製造本發明化合物之中間體。式(2)所示之化合物落入本發明範疇。該化合物之具體且較佳例包括其中各取代基係與本發明化合物相同(如上具體說明書)之式(2)化合物。

接著，說明於本發明化合物製備中所使用之中間體之製備方法。

(參考製備方法 1)

化合物(2)中，其中 R^6 為氫原子之化合物(2-1)，可經由實施其中之化合物(6)與亞硝酸化合物反應之第 1 步驟以及其中將由第 1 步驟所得之化合物與還原劑(8)反應之第 2 步驟而製得：



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^5 、G 及 m 係如上文所定義。

反應通常在溶劑中進行。

溶劑之實例包含水；醚類，例如四氫呋喃、乙醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚及 1,4-二噁烷；羧醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺；芳族烴類，例如甲苯及二甲苯；亞砜類，例如二甲亞砜及環丁砜；鹵化烴類，例如 1,2-二氯乙烷、氯仿及氯苯；及其混合物。

亞硝酸化合物(7)之實例包含亞硝酸鹽類，例如亞硝酸鈉；及亞硝酸酯類，例如亞硝酸乙酯。

還原劑(8)之實例包含亞硫酸鹽類，例如亞硫酸鈉；金屬類，例如鋅；及氯化錫(II)。

亞硝酸化合物(7)之用量對於每 1 莫耳化合物(6)通常為 1 至 10 莫耳。

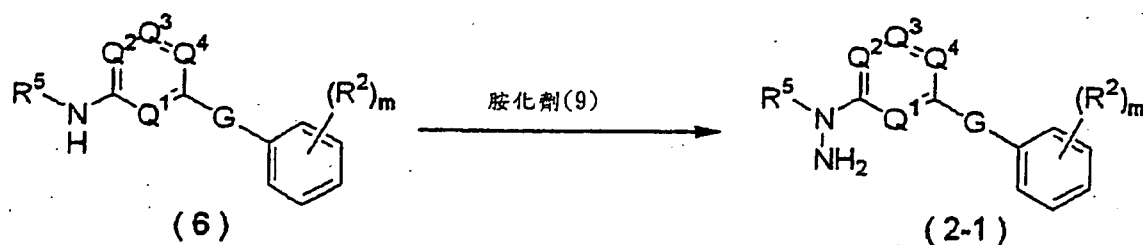
還原劑(8)之用量對於每 1 莫耳化合物(6)通常為 1 至 10 莫耳。

第 1 步驟中之反應溫度通常為 -20 至 30°C 的範圍，且第 1 步驟中之反應時間通常為 0.5 至 24 小時的範圍。

第 1 步驟中所獲得之反應混合物可以其原樣使用於第 2 步驟，其中其係與還原劑(8)反應。第 2 步驟中之反應溫度通常為 -20 至 50°C 的範圍，且第 2 步驟中之反應時間通

(參考製備方法 2)

化合物(2)中，其中 R^6 為氫原子之化合物(2-1)，可經由將化合物(6)與胺化劑(9)反應而製得：



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^5 、 G 及 m 係如上文所定義。

反應通常在溶劑中進行。

溶劑之實例包含水；醚類，例如四氫呋喃、乙醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚及 1,4-二噁烷；羧醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺；芳族烴類，例如甲苯及二甲苯；亞砷類，例如二甲亞砷及環丁砷；鹵化烴類，例如 1,2-二氯乙烷、氯仿及氯苯；及其混合物。

反應通常於鹼存在下進行。

鹼之實例包含鹼金屬氫化物類，例如氫化鈉；碳酸鹽類，例如碳酸鉀；鹼金屬烷醇類，例如第三丁醇鉀；金屬氫氧化物，例如氫氧化鈉；及有機胺類，例如三乙胺及吡啶。

胺化劑(9)之實例包含氯胺類，例如氯胺；0-醯基羥

基胺類，例如 0-三甲基苯甲醯基羥基胺；0-磺醯基羥基胺；及羥基胺-0-磺酸。

替代添加該胺化劑(9)，可將該胺化劑之材料添加至反應系統，以同時實施胺化劑(9)之合成以及化合物(6)與胺化劑(9)之反應。例如，次氯酸鈉與氨可添加至反應系統來替代添加氯胺作為胺化劑(9)。

胺化劑(9)之用量對於每 1 莫耳化合物(6)通常為 1 至 10 莫耳。

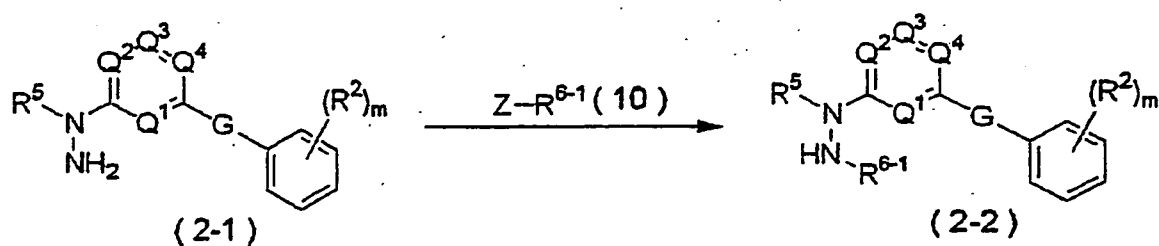
鹼之用量對於每 1 莫耳化合物(6)通常為 1 至 10 莫耳。

反應溫度通常為 0 至 100°C 的範圍，且反應時間通常為 0.5 至 24 小時的範圍。

反應完成後，化合物(2-1)可經由後處理而單離，例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。經單離之化合物(2-1)可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

(參考製備方法 3)

化合物(2)中，其中 R^6 為 R^{6-1} 之化合物(2-2)，可經由將化合物(2-1)與化合物(10)反應而製得：



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^5 、 G 、 Z 及 m 係如上文所定義，以及 R^{6-1} 表示視需要經選自群 E1 之基團取代之 C1-C12 鏈烴基、視需要經選自 E2 群之基團取代之苯甲醯

基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C3-C12 環烷基或甲鹽基。

反應通常在溶劑中進行。

溶劑之實例包含醚類，例如四氫呋喃、乙醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚及 1,4-二噁烷；羧鹽胺類，例如 N,N-二甲基甲鹽胺；腈類，例如乙腈；芳族烴類，例如甲苯及二甲苯；酯類，例如乙酸乙酯；亞砜類，例如二甲亞砜及環丁砜；鹵化烴類，例如 1,2-二氯乙烷、氯仿及氯苯；及其混合物。

反應通常於鹼存在下進行。

鹼之實例包含鹼金屬氫化物類，例如氫化鈉；碳酸鹽類，例如碳酸鉀；鹼金屬烷醇類，例如第三丁醇鉀；及有機胺類，例如三乙胺及吡啶。

化合物(10)之用量對於每 1 莫耳化合物(2-1)通常為 1 至 10 莫耳。

鹼之用量對於每 1 莫耳化合物(2-1)通常為 1 至 10 莫耳。

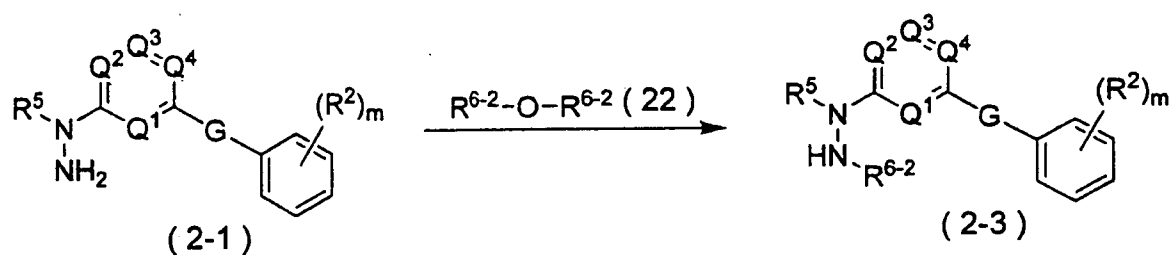
反應溫度通常為 0 至 100°C 的範圍，且反應時間通常為 0.5 至 24 小時的範圍。

反應完成後，化合物(2-2)可經由後處理而單離，例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。經單離之化合物(2-2)可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

(參考製備方法 4)

化合物(2)中，其中 R^6 為 R^{6-2} 之化合物(2-3)，可經由

將化合物(2-1)與化合物(22)反應而製得：



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 R^5 、 G 及 m 係如上文所定義，以及 R^{6-2} 表示視需要經選自 E2 群之基團取代之苯甲醯基、C2-C6 烷基羰基或 C2-C6 烷氧基羰基。

若有需要，反應可在溶劑中進行。

溶劑之實例包含醚類，例如四氫呋喃、乙醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚及 1,4-二噁烷；羧醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺；腈類，例如乙腈；芳族烴類，例如甲苯及二甲苯；酯類，例如乙酸乙酯；亞砜類，例如二甲亞砜及環丁砜；鹵化烴類，例如 1,2-二氯乙烷、氯仿及氯苯；及其混合物。

若有需要，反應亦可於鹼存在下進行。

鹼之實例包含鹼金屬氫化物類，例如氫化鈉；碳酸鹽類，例如碳酸鉀；鹼金屬烷醇類，例如第三丁醇鉀；及有機胺類，例如三乙胺、吡啶、4-(二甲基胺基)吡啶及咪唑。

化合物(22)之用量對於每 1 莫耳化合物(2-1)通常為 1 至 10 莫耳。

若於反應中使用鹼，鹼之用量對於每 1 莫耳化合物(2-1)通常為 1 至 10 莫耳。

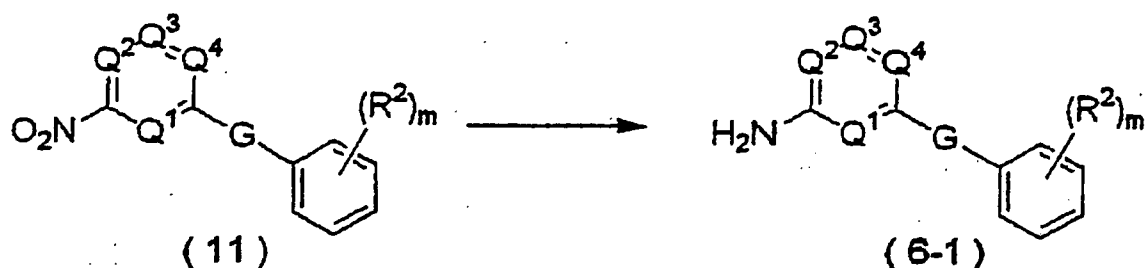
反應溫度通常為 0 至 100°C 的範圍，且反應時間通常

為 0.5 至 24 小時的範圍。

反應完成後，化合物(2-3)可經由後處理而單離，例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。經單離之化合物(2-3)可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

(參考製備方法 5)

化合物(6)中，其中 R^5 為氫原子之化合物(6-1)，可經由將化合物(11)以下述方法(i)至(iii)之任一者予以還原而製得。



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、G 及 m 係如上文所定義。

(i) 包括於過渡金屬催化劑存在下以氫氣進行反應之方法

反應係在溶劑中進行。

溶劑之實例包含酯類，例如乙酸乙酯；醇類，例如乙醇及甲醇；水、乙酸、氫氯酸及其混合物。

過渡金屬催化劑之實例包含雷氏鎳、鈀-碳及二氧化鉑。

過渡金屬催化劑之用量對於每 1 莫耳化合物(11)通常為 0.01 至 0.5 莫耳。

氫氣之用量對於每 1 莫耳化合物(11)通常為 1 至 100 莫耳。

反應溫度通常為 0 至 80°C 的範圍，且反應時間通常為

0.1至24小時的範圍。

反應完成後，化合物(6-1)可經由後處理而單離，例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。經單離之化合物(6-1)可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

(i) 包括於鹼存在下以胍類進行反應之方法

反應係在溶劑中進行。

溶劑之實例包含醚類，例如二乙二醇及三乙二醇；水；及其混合物。

鹼之實例包含鹼金屬氫氧化物類，例如氫氧化鉀。

胍類之實例包含胍類水合物。

鹼之用量對於每1莫耳化合物(11)通常為1至10莫耳。

胍類之用量對於每1莫耳化合物(11)通常為1至10莫耳。

反應溫度通常為0至100°C的範圍，且反應時間通常為0.5至24小時的範圍。

反應完成後，化合物(6-1)可經由後處理而單離，例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。經單離之化合物(6-1)可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

(ii) 包括於酸存在下以金屬進行反應之方法

反應通常在溶劑中進行。

溶劑之實例包含醇類，例如乙醇；水；及其混合物。

金屬之實例包含鐵、鋅、錫及氯化錫(II)。

酸之實例包含乙酸、氫氯酸及硫酸。

醯胺類，例如 N, N-二甲基甲醯胺；腈類，例如乙腈；芳族烴類，例如甲苯及二甲苯；酯類，例如乙酸乙酯；亞砜類，例如二甲亞砜及環丁砜；鹵化烴類，例如 1, 2-二氯乙烷、氯仿及氯苯；及其混合物。

反應通常於鹼存在下進行。

鹼之實例包含鹼金屬氫化物類，例如氫化鈉；碳酸鹽類，例如碳酸鉀；鹼金屬烷醇類，例如第三丁醇鉀；及有機胺類，例如三乙胺及吡啶。

所使用之化合物(22)之量對於每 1 莫耳化合物(6-1)通常為 1 至 10 莫耳。

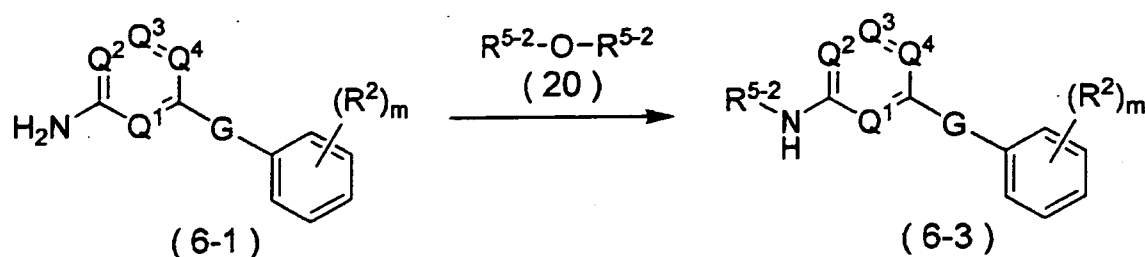
所使用之鹼之量對於每 1 莫耳化合物(6-1)通常為 1 至 10 莫耳。

反應溫度通常為 0 至 100°C 的範圍，且反應時間通常為 0.5 至 24 小時的範圍。

反應完成後，化合物(6-2)可經由後處理而單離，例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。經單離之化合物(6-2)可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

(參考製備方法 7)

化合物(6)中，其中 R⁵ 為 R⁵⁻² 之化合物(6-3)，可經由將化合物(6-1)與化合物(20)反應而製得：



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^2 、 G 及 m 係如上文所定義，以及 R^{5-2} 表示視需要經選自 E2 群之基團取代之苯甲醯基、C2-C6 烷基羰基或 C2-C6 烷氧基羰基。

若有需要，反應可在溶劑中進行。

用於反應之溶劑之實例包含醚類，例如四氫呋喃、乙醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚及 1,4-二噁烷；羧醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺；腈類，例如乙腈；芳族烴類，例如甲苯及二甲苯；酯類，例如乙酸乙酯；亞砜類，例如二甲亞砜及環丁砜；鹵化烴類，例如 1,2-二氯乙烷、氯仿及氯苯；及其混合物。

若有需要，反應可於鹼存在下進行。

鹼之實例包含鹼金屬氫化物類，例如氫化鈉；碳酸鹽類，例如碳酸鉀；鹼金屬烷醇類，例如第三丁醇鉀；及有機胺類，例如三乙胺、吡啶、4-(二甲基胺基)吡啶及咪唑。

所使用之化合物(20)之量對於每 1 莫耳化合物(6-1)通常為 1 至 10 莫耳。

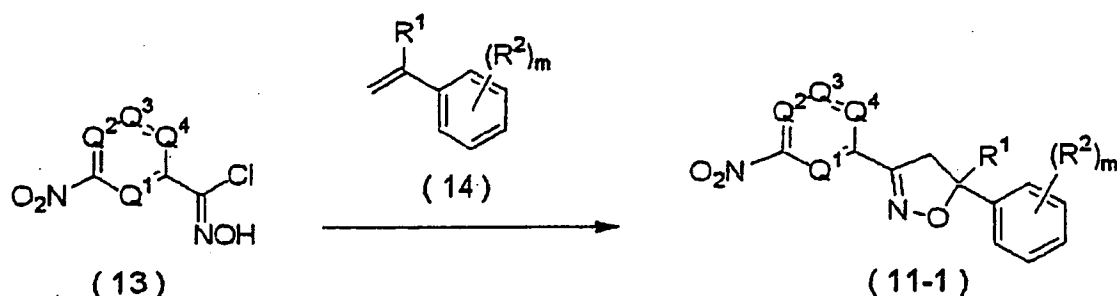
若於反應中使用鹼，鹼之用量對於每 1 莫耳化合物(6-1)通常為 1 至 10 莫耳。

反應溫度通常為 0 至 100°C 的範圍，且反應時間通常為 0.5 至 24 小時的範圍。

反應完成後，化合物(6-3)可經由後處理而單離，例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。經單離之化合物(6-3)可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

(參考製備方法 8)

化合物(11)中，其中 G 為式 G-1 所示之 5-員雜環且 Y¹ 為氧原子之化合物(11-1)，可經由實施其中之化合物(13)與鹼反應之第 1 步驟以及其中將由第 1 步驟所得之產物與化合物(14)反應之第 2 步驟而製得：



式中，Q¹、Q²、Q³、Q⁴、R¹、R²及 m 係如上文所定義。

反應通常在溶劑中進行。

溶劑之實例包含醚類，例如四氫呋喃、乙醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚及 1,4-二噁烷；羧醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺；腈類，例如乙腈；烴類，例如甲苯；酯類，例如乙酸乙酯；亞砷類，例如二甲亞砷；及其混合物。

鹼之實例包含鹼金屬氫化物類，例如氫化鈉；碳酸鹽類，例如碳酸鉀；鹼金屬烷醇類，例如第三丁醇鉀；及有機胺類，例如三乙胺及吡啶。

所使用之鹼之量對於每 1 莫耳化合物(13)通常為 1 至 10 莫耳。

用於反應之化合物(14)之量對於每 1 莫耳化合物(13)通常為 1 至 10 莫耳。

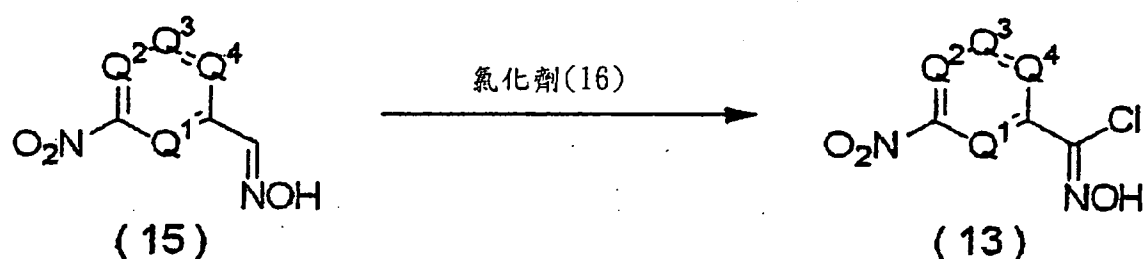
第 1 步驟中之反應溫度通常為 0 至 80°C 的範圍，且第 1 步驟中之反應時間通常為 0.5 至 24 小時的範圍。

第 1 步驟中所獲得之反應混合物可不經純化而使用於第 2 步驟。第 2 步驟中之反應溫度通常為 0 至 80°C 的範圍，且第 2 步驟中之反應時間通常為 0.5 至 24 小時的範圍。

反應完成後，化合物(11-1)可經由後處理而單離，例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。經單離之化合物(11-1)可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

(參考製備方法 9)

化合物(13)可經由將化合物(15)與氯化劑(16)反應而製得：



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 係如上文所定義。

反應通常在溶劑中進行。

溶劑之實例包含醚類，例如四氫呋喃、乙醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚及 1,4-二噁烷；烴類，例如甲苯；酯類，例如乙酸乙酯；羧醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺；腈類，例如乙腈；亞砷類，例如二甲亞砷；及其混合物。

氯化劑(16)之實例包含氯氣及 N-氯琥珀醯亞胺。

所使用之氯化劑(16)之用量對於每 1 莫耳化合物(15)通常為 1 至 10 莫耳。

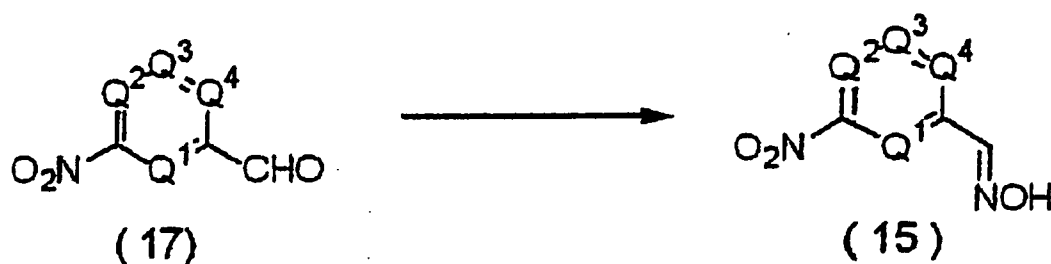
反應溫度通常為 -20 至 80°C 的範圍，且反應時間通常

為 0.5 至 24 小時的範圍。

反應完成後，化合物(13)可經由後處理而單離，例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。經單離之化合物(13)可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

(參考製備方法 10)

化合物(15)可經由化合物(17)與羥基胺而製得：



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 係如上文所定義。

反應通常在溶劑中進行。

溶劑之實例包含醚類，例如四氫呋喃、乙醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚及 1,4-二噁烷；烴類，例如甲苯；酯類，例如乙酸乙酯；羧醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺；醇類，例如乙醇及甲醇；腈類，例如乙腈；亞砜類，例如二甲亞砜；水；及其混合物。

羥基胺之實例包含於反應系統中能產生羥基胺之鹽類。該鹽之實例包含羥基胺與礦酸之鹽類，例如羥基胺鹽酸鹽及羥基胺硫酸鹽。

反應所使用之羥基胺之量對於每 1 莫耳化合物(17)通常為 1 至 10 莫耳。

當使用羥基胺與無機酸之鹽時，反應係於鹼存在下進行。

鹼之實例包含有機胺類，例如三乙胺；碳酸鹽類，例如碳酸鈉；及鹼金屬氫氧化物類，例如氫氧化鈉。

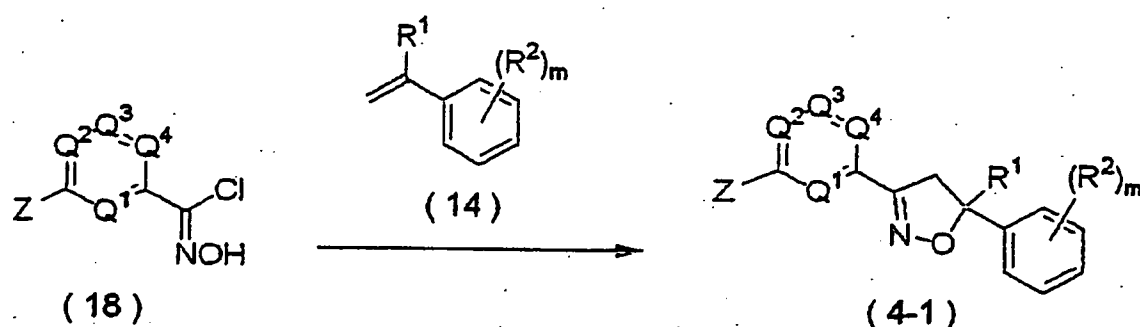
所使用之鹼之量對於每 1 莫耳羥基胺與無機酸之鹽通常為 1 至 10 莫耳。

反應溫度通常為 0 至 80°C 的範圍，且反應時間通常為 0.5 至 24 小時的範圍。

反應完成後，化合物(15)可經由後處理而單離，例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。經單離之化合物(15)可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

(參考製備方法 11)

化合物(4)中，其中 G 為式 G-1 所示之 5-員雜環且 Y¹ 為氧原子之化合物(4-1)，可經由實施其中之化合物(18)與鹼反應之步驟 I 以及其中將步驟 I 所得之產物與化合物(14)反應之步驟 II 而製得：



式中，Q¹、Q²、Q³、Q⁴、R¹、R²、Z 及 m 係如上文所定義。

反應通常在溶劑中進行。

溶劑之實例包含醚類，例如四氫呋喃、乙醚、第三丁基甲基醚、乙二醇二甲基醚及 1,4-二噁烷；羧醯胺類，例如 N,N-二甲基甲醯胺；腈類，例如乙腈；烴類，例如甲苯；

酯類，例如乙酸乙酯；亞碲類，例如二甲亞碲；及其混合物。

鹼之實例包含鹼金屬氫化物類，例如氫化鈉；碳酸鹽類，例如碳酸鉀；鹼金屬烷醇類，例如第三丁醇鉀；及有機胺類，例如三乙胺及吡啶。

用於反應之化合物(14)之量對於每 1 莫耳化合物(18)通常為 1 至 10 莫耳。

所使用之鹼之量對於每 1 莫耳化合物(18)通常為 1 至 10 莫耳。

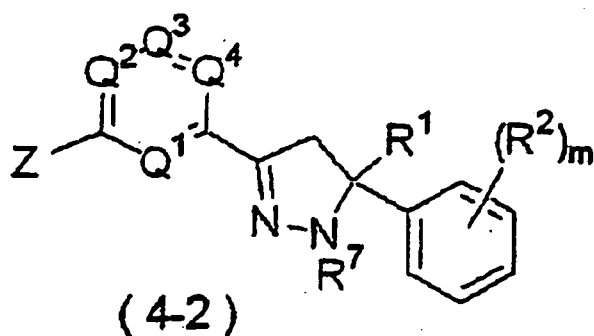
步驟 I 中之反應溫度通常為 0 至 80°C 的範圍，且步驟 I 中之反應時間通常為 0.5 至 24 小時的範圍。

步驟 I 中所獲得之反應混合物可不經純化而使用於步驟 II。步驟 II 中之反應溫度通常為 0 至 80°C 的範圍，且步驟 II 中之反應時間通常為 0.5 至 24 小時的範圍。

反應完成後，化合物(4-1)可經由後處理而單離，例如經由以有機溶劑萃取反應混合物，乾燥後濃縮。經單離之化合物(4-1)可經由層析、再結晶作用等而進一步純化。

(參考製備方法 12)

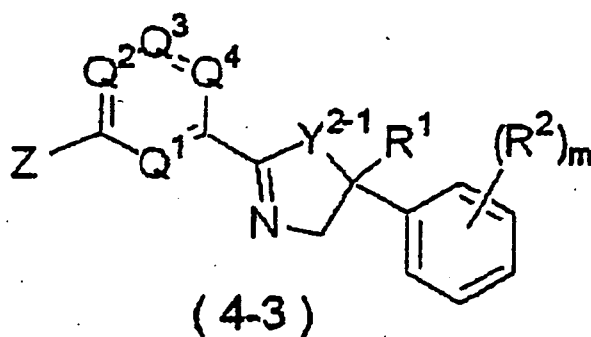
化合物(4)中，其中 G 為式 G-1 所示之 5-員雜環且 Y¹ 為 NR⁷ 之化合物(4-2)，可經由例如揭示於 WO 2007-123855 之方法而製得。



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^1 、 R^2 、 R^7 、 Z 及 m 係如上文所定義。

(參考製備方法 13)

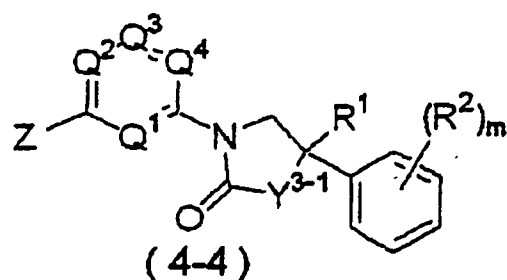
化合物(4)中，其中 G 為式 G-2 所示之 5-員雜環且 Y^2 為 Y^{2-1} 之化合物(4-3)，可經由例如揭示於 JP-A 2007-91708 之方法而製得。



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^1 、 R^2 、 Z 及 m 係如上文所定義，且 Y^{2-1} 表示氧原子、硫原子或亞甲基。

(參考製備方法 14)

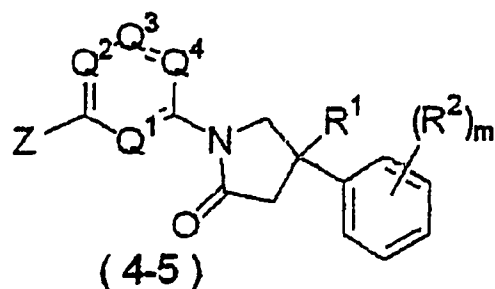
化合物(4)中，其中 G 為式 G-3 所示之 5-員雜環且 Y^3 為 Y^{3-1} 之化合物(4-4)，可經由例如揭示於 WO 2007/123853 之方法而製得。



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^1 、 R^2 、 Z 及 m 係如上文所定義，且 Y^{3-1} 表示氧原子或 NR^7 ，且 R^7 係如上文所定義。

(參考製備方法 15)

化合物(4)中，其中 G 為式 $G-3$ 且 Y^3 為亞甲基之化合物(4-5)，可經由例如揭示於 JP-A 2008-110971 之方法而製得。



式中， Q^1 、 Q^2 、 Q^3 、 Q^4 、 R^1 、 R^2 、 Z 及 m 係如上文所定義。

本發明之化合物對其呈現效力之有害生物之實例包含節肢有害生物例如有害昆蟲及有害蟲蝨，以及線形動物例如線虫，且更具體地包含下述有害生物。

半翅目(Hemiptera)：

飛蝨(飛蝨科(Delphacidae))諸如小褐飛蝨(small brown planthopper)(斑飛蝨(*Laodelphax striatellus*))、褐稻飛蝨(褐飛蝨(*Nilaparvata lugens*))、及白背稻飛蝨(白背飛蝨(*Sogatella furcifera*))；葉蟬(leafhopper)(浮塵子科(Deltocephalidae))諸如青稻葉蟬(黑尾葉蟬

(*Nephotettix cincticeps*))、青稻葉蟬(二點黑尾葉蟬(*Nephotettix virescens*))、及茶小綠葉蟬(小綠葉蟬(*Empoasca onukii*))；蚜蟲(蚜科(*Aphididae*))諸如棉蚜(棉蚜(*Aphis gossypii*))、綠桃蚜(桃蚜(*Myzus persicae*))、甘藍蚜(甘藍蚜(*Brevicoryne brassicae*))、繡線菊蚜(*spiraea aphid*)(繡線菊蚜(*Aphis spiraeicola*))、馬鈴薯蚜(馬鈴薯蚜(*Macrosiphum euphorbiae*))、毛地黃蚜(*foxglove aphid*)(茄溝無網蚜(*Aulacorthum solani*))、燕麥黍縊蚜(*oat bird-cherry aphid*)(禾穀縊管蚜(*Rhopalosiphum padi*))、大桔蚜(*tropical citrus aphid*)(桔蚜(*Toxoptera citricidus*))、及桃大尾蚜(*mealy plum aphid*)(桃粉蚜(*Hyalopterus pruni*))；臭蟲(椿科(*Pentatomidae*))諸如綠臭蟲(稻綠椿象(*Nezara antennata*))、豆綠椿(點蜂緣椿象(*Riptortus clavetus*))、米蟲(中華稻緣椿(*Leptocorisa chinensis*))、白斑黑臭蟲(白星椿(*Eysarcoris parvus*))、及臭蟲(大綠椿(*Halyomorpha mista*))；粉蝨(粉蝨科(*Aleyrodidae*))諸如溫室白粉蝨(溫室粉蝨(*Trialeurodes vaporariorum*))、菸草粉蝨(*sweetpotato whitefly*)(菸草粉蝨(*Bemisia tabaci*))、銀葉粉蝨(*silver leaf whitefly*)(銀葉粉蝨(*Bemisia argentifolii*))、柑桔粉蝨(柑桔粉蝨(*Dialeurodes citri*))、及柑桔刺粉蝨(茶黑刺粉蝨(*Aleurocanthus spiniferus*))；介殼蟲(軟介殼蟲科(*Coccidae*))諸如桔紅

腎圓盾介殼蟲(California red scale)(紅圓介殼蟲(*Aonidiella aurantii*))、聖瓊斯介殼蟲(San Jose scale)(梨圓介殼蟲(*Comstockaspis perniciososa*))、北柑介殼蟲(citrus north scale)(桔矢尖介殼蟲(*Unaspis citri*))、紅臘介殼蟲(紅臘介殼蟲(*Ceroplastes rubens*))、吹綿介殼蟲(吹綿介殼蟲(*Icerya purchasi*))、日本水臘蟲(臀紋粉介殼蟲(*Planococcus kraunhiae*))、梨粉介殼蟲(Comstock mealybug)(長尾粉介殼蟲(*Pseudococcus longispinus*))、及桑白介殼蟲(white peach scale)(桑介殼蟲(*Pseudaulacaspis pentagona*))；軍配蟲(軍配蟲科(Tingidae))；木蝨(木蝨科(Psyllidae))等；

鱗翅目(Lepidoptera)：

螟蛾(螟蛾科(Pyralidae))諸如鑽心蟲(二化螟蛾(*Chilo suppressalis*))、稻黃螟蟲(三化螟蛾(*Tryporyza incertulas*))、稻大卷葉螟(稻縱捲葉野螟蛾(*Cnaphalocrocis medinalis*))、棉大卷葉螟(棉捲葉野螟(*Notarcha derogata*))、印度粉螟(印度穀粉螟蛾(*Plodia interpunctella*))、亞洲玉米螟(*Ostrinia furnacalis*)、甘藍螟(cabbage webworm)(菜螟(*Hellula undalis*))、及早熟禾草螟(bluegrass webworm)(早熟禾草螟(*Pediasia teterrellus*))；夜蛾(夜蛾科(Noctuidae))諸如普通夜盜蟲(斜紋夜蛾(*Spodoptera litura*))、甜菜行軍蟲(beet armyworm)(甜菜葉蛾(*Spodoptera exigua*))、稻行軍蟲(東

方黏蟲(*Pseudaletia separata*)、甘藍行軍蟲(甘藍夜蛾(*Mamestra brassicae*))、切根蟲(black cutworm)(球莖夜蛾(*Agrotis ipsilon*))、甜菜斜紋夜蛾(beet semi-looper)(黑點銀紋夜蛾(*Plusia nigrisigna*))、夜蛾屬(*Thoricoplusia* spp.)、棉鈴蟲屬(*Heliothis* spp.)及葉蛾屬(*Helicoverpa* spp.)；紋白蝶(粉蝶科(*Pieridae*))諸如普通菜粉蝶(紋白蝶(*Pieris rapae*))；捲蛾(捲蛾科(*Tortricidae*))諸如小捲葉蛾屬(*Adoxophyes* spp.)、東方果蛾(oriental fruit moth)(梨小食心蟲(*Grapholita molesta*))、大豆食心蟲(豆捲葉螟(*Leguminivora glycinivorella*))、紅豆豆蟲(azuki bean podworm)(豆小捲葉蛾(*Matsumuraeses azukivora*))、夏果捲葉蛾(小角紋捲葉蛾(*Adoxophyes orana fasciata*))、茶小捲葉蛾(茶小捲葉蛾(*Adoxophyes* sp.))、東方茶小捲葉蛾(茶長捲葉蛾(*Homona magnanima*))、蘋果捲葉蛾(亂紋蘋果捲葉蛾(*Archips fuscocupreanus*))、及蠹蛾(蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*))；潛葉蟲(細蛾科(*Gracillariidae*))諸如茶捲葉蛾(茶細蛾(*Caloptilia theivora*))、及蘋果潛葉蛾(潛葉蛾(*Phyllonorycter ringoneella*))；果蛀蛾科(*Carposinidae*)諸如桃果蛀蛾(桃小食心蟲(*Carposina niponensis*))；潛蛾(潛蛾科(*Lyonetiidae*))諸如潛蛾屬(*Lyonetia* spp.)；毒蛾(毒蛾科(*Lymantriidae*))諸如毒蛾屬(*Lymantria* spp.)及毛蟲屬(*Euproctis* spp.)；巢蛾(巢蛾科(*Yponomeutidae*))諸如鑽石背蛾(diamondback moths)

(小菜蛾(*Plutella xylostella*))；麥蛾(麥蛾科(Gelechiidae))諸如棉紅鈴蟲(pink bollworm)(棉紅鈴蟲(*Pectinophora gossypiella*))及馬鈴薯管蟲(馬鈴薯塊莖蛾(*Phthorimaea operculella*))；老虎蛾及燈蛾(燈蛾科(Arctiidae))諸如秋幕蛾(美國白蛾(*Hyphantria cunea*))；谷蛾(谷蛾科(Tineidae))諸如製袋衣蛾(casemaking clothes moth)(幕衣蛾(*Tinea translucens*))及織網衣蛾(webbing clothes moth)(衣蛾(*Tineola bisselliella*))等；

纓翅目(Thysanoptera)：

柑橘黃薊馬(yellow citrus thrips)(西方花薊馬(*Frankliniella occidentalis*))、南黃薊馬(瓜薊馬(*Thrips palmi*))、茶黃薊馬(小黃薊馬(*Scirtothrips dorsalis*))、蔥薊馬(蔥薊馬(*Thrips tabaci*))、花薊馬(黑腹薊馬(*Frankliniella intonsa*))等；

雙翅目(Diptera)：

蠅(普通家蠅(*Musca domestica*))、普通蚊子(淡色庫蚊(*Culex pipiens pallens*))、馬蠅(三角虻(*Tabanus trigonus*))、蔥蠅(onion maggot)(灰蔥蠅(*Hylemya antique*))、種蠅(seedcorn maggot)(種蠅(*Hylemya platura*))、中華瘧蚊(*Anopheles sinensis*)、稻潛葉蠅(稻潛蠅(*Agromyza oryzae*))、稻潛葉蠅(稻小潛葉蠅(*Hydrellia griseola*))、稻稈潛蠅(稻稈潛蠅(*Chlorops oryzae*))、瓜實蠅(瓜實蠅(*Dacus cucurbitae*))、地中海

實蠅(Mediterranean fruit fly) (地中海實蠅(*Ceratitis capitata*))、豆潛葉蠅(非洲菊斑潛蠅(*Liriomyza trifolii*))、番茄斑潛蠅(蔬菜斑潛蠅(*Liriomyza sativae*))、豌豆潛葉蠅(豌豆潛葉蠅(*Chromatomyia horticola*))等；

鞘翅目(Coleoptera)：

茄二十八星瓢蟲(twenty-eight-spotted ladybird)(茄二十八星瓢蟲(*Epilachna vigintioctopunctata*))、黃守瓜(cucurbit leaf beetle)(黃守瓜(*Aulacophora femoralis*))、黃條葉蚤(striped flea beetle)(黃條葉蚤(*Phyllotreta striolata*))、稻泥蟲(稻負泥蟲(*Oulema oryzae*))、稻象甲(rice curculio)(稻象鼻蟲(*Echinocnemus squameus*))、稻水象甲(rice water weevil)(稻水象甲(*Lissorhoptrus oryzophilus*))、棉鈴象甲(boll weevil)(棉鈴象甲(*Anthonomus grandis*))、綠豆象甲(azuki been weevil)(綠豆象(*Callosobruchus chinensis*))、狩獵象甲(hunting billbug)(黑楔象鼻蟲(*Sphenophorus venatus*))、日本麗金龜(日本金龜(*Popillia japonica*))、綠金龜(cupreous chafer)(金銅金龜(*Anomala cuprea*))、玉米食根蟲(corn root worms)(葉甲屬(*Diabrotica* spp.))、科羅拉多甲蟲(科羅拉多金花蟲(*Leptinotarsa decemlineata*))、叩頭蟲(叩頭蟲屬(*Agriotes* spp.))、煙草甲蟲(cigarette beetle)(煙甲蟲(*Lasioderma*

serricorne))、姬圓鯨節蟲(varied carpet beetle)(姬圓鯨節蟲(*Anthrenus verbasci*))、赤擬穀盜(red flour beetle)(赤擬穀盜(*Tribolium castaneum*))、粉蠹蟲(powder post beetle)(褐粉蠹(*Lyctus brunneus*))、斑星天牛(white-spotted longicorn beetle)(星天牛(*Anoplophora malasiaca*))、松梢甲蟲(pine shoot beetle)(縱坑切梢小蠹(*Tomicus piniperda*))等；

直翅目(Orthoptera)：

亞洲蝗蟲(Asiatic locust)(飛蝗(*Locusta migratoria*))、非洲螻蛄(African mole cricket)(非洲螻蛄(*Gryllotalpa africana*))、稻蝗(小翅稻蝗(*Oxya yezoensis*))、稻蝗(日本稻蝗(*Oxya japonica*))等；

膜翅目(Hymenoptera)：

甘藍葉蜂(黃翅菜葉蜂(*Athalia rosae*))、切葉蟻(切葉蟻屬(*Acromyrmex* spp.))、火蟻(火蟻屬(*Solenopsis* spp.))等；

線蟲目(Nematode)：

水稻幹尖線蟲(*Aphelenchoides besseyi*)、草莓芽線蟲(*Nothotylenchus acris*)、南方根結線蟲(southern root-knot nematoda)(黃瓜根結線蟲(*Meloidogyne incognita*))、北方根結線蟲(花生根結線蟲(*Meloidogyne hapla*))、爪哇切根線蟲(*Meloidogyne javanica*)、大豆孢囊線蟲(soybean cyst nematode)(大豆孢囊線蟲(*Heterodera glycines*))、馬鈴薯孢囊線蟲(馬鈴薯金黃線

蟲(*Globodera rostochiensis*))、咖啡根腐線蟲(coffee root-lesion nematode)(咖啡短體線蟲(*Pratylenchus coffeae*))、加州根腐線蟲(落選短體線蟲(*Pratylenchus neglectus*))等。

蜚蠊目(Blattodea)：

德國蟑螂(德國蜚蠊(*Blattella germanica*))、煙褐蟑螂(黑胸大蠊(*Periplaneta fuliginosa*))、美洲蟑螂(美洲蜚蠊(*Periplaneta americana*))、棕色蜚蠊(*Periplaneta brunnea*)、東方蟑螂(東方蜚蠊(*Blatta orientalis*))等；

蜱蟎目(Acarina)：

葉蟎(葉蟎科(Tetranychidae))諸如二點葉蟎(二斑葉蟎(*Tetranychus urticae*))、神澤葉蟎(Kanzawa spider mite)(神澤葉蟎(*Tetranychus kanzawai*))、柑桔紅蜘蛛(柑桔全爪蟎(*Panonychus citri*))、歐洲紅蟎(European red mite)(榆全爪蟎(*Panonychus ulmi*))及小爪蟎屬(*Oligonychus* spp.)；瘿蟎(eriophyid mites)(瘿蟎科(Eriophyidae))諸如柑桔銹蟎(刺皮節蟎(*Aculops pelekassi*))、銹蟎(*Phyllocoptruta citri*)、番茄刺皮瘿蟎(番茄刺皮瘿蟎(*Aculops lycopersici*))、紫茶蟎(purple tea mite)(紫銹蟎(*Calacarus carinatus*))、茶橙瘿蟎(pink tea rust mite)(茶橙瘿蟎(*Acaphylla theavagran*))及梨銹蟎(*Eriophyes chibaensis*)；細蟎(tarsonemid mites)(細蟎科(Tarsonemidae))諸如茶細

蟎(broad mite)(茶黃蟎(*Polyphagotarsonemus latus*)) ;
 擬葉蟎(false spider mites)(擬葉蟎科(*Tenuipalpidae*))
 諸如紫偽葉蟎(*Brevipalpus phoenicis*) ; 杜克葉蟎科
 (*Tuckerellidae*) ; 蜱(硬蜱科(*Ixodidae*))諸如長角血蜱
 (*Haemaphysalis longicornis*)、血蜱(*Haemaphysalis*
flava)、台灣革蜱(*Dermacentor taiwanicus*)、卵形硬蜱
 (*Ixodes ovatus*)、全溝硬蜱(*Ixodes persulcatus*)、微小
 牛蜱(*Boophilus microplus*)及棕色犬壁蝨
 (*Rhipicephalus sanguineus*) ; 粉蟎(粉蟎科(*Acaridae*))
 諸如霉蟎(mold mite)(腐食酪蟎(*Tyrophagus*
putrescentiae))及腐食酪蟎(*Tyrophagus similis*) ; 家居
 塵蟎(塵蟎科(*Pyroglyphidae*))諸如美洲塵蟎
 (*Dermatophagoides farinae*)、及歐洲塵蟎
 (*Dermatophagoides pteromyssus*) ; 肉食蟎(肉食蟎科
 (*Cheyletidae*))諸如普通肉食蟎(*Cheyletus eruditus*)、
 馬六甲肉食蟎(*Cheyletus malaccensis*)及肉食蟎
 (*Cheyletus moorei*) ; 禽紅蟎(poultry red mite)等 ;

雖然本發明之有害生物防治組成物可為本發明之化
 合物本身，但本發明之有害生物防治組成物通常包括本發
 明之化合物作為活性成分且呈調配物形式例如乳化濃縮
 物、油狀溶液、粉劑、粒劑、可濕性粉劑、可流動性調配
 物、微膠囊調配物、氣霧調配物、煙燻劑、毒餌或樹脂調
 配物。

該調配物通常包含 0.01 至 95 重量%之本發明化合物。

該調配物通常可藉由將本發明化合物與惰性載劑，以及若需要時與調配物用之界面活性劑或其他輔劑混合而製備。

惰性載劑之實例包含固體載劑、液體載劑及氣體載劑。

固體載劑之實例包含黏土(例如高嶺土、矽藻土、膨潤土、富巴沙黏土(Fubasami clay)、或酸性黏土等)之細粉末或顆粒、合成性水合氧化矽、滑石、陶瓷、其他無機礦物(例如絹雲母、石英、硫、活性碳、碳酸鈣、或水合氧化矽)及化學肥料(例如硫酸銨、磷酸銨、硝酸銨、氯化銨、或尿素)。

液體載劑之實例包含水、醇類(例如甲醇、乙醇、異丙醇、丁醇、己醇、苯甲醇、乙二醇、丙二醇、苯氧基乙醇等)、酮類(例如丙酮、甲基乙基酮、環己酮等)、芳香族烴類(例如甲苯、二甲苯、乙基苯、十二基苯、苯基二甲苯基乙烷、甲基萘等)、脂族烴類(例如己烷、環己烷、煤油、汽油等)、酯類(例如乙酸乙酯、乙酸丁酯、肉豆蔻酸異丁酯、油酸乙酯、己二酸二異丙酯、己二酸二異丁酯、丙二醇單甲基醚乙酸酯等)、腈類(例如乙腈、或異丁腈)、醚類(例如異丙醚、1,4-二噁烷、乙二醇二甲醚、二乙二醇二甲醚、二乙二醇單甲醚、丙二醇單甲醚、二丙二醇單甲醚、3-甲氧基-3-甲基-1-丁醇等)、羧醯胺類(例如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺等)、鹵化烴類(例如二氯甲烷、二氯乙烷、四氯化碳等)、亞砷類(例如二甲亞砷等)、及碳

酸丙二酯、及植物油(例如大豆油、棉籽油等)。

氣體載劑之實例包含氟碳化物、丁烷氣體、液化石油氣(LPG)、甲醚、及二氧化碳氣體。

界面活性劑之實例包含非離子性界面活性劑例如聚氧伸乙基烷基醚類、聚氧伸乙基烷基芳基醚類及聚乙二醇脂肪酸酯類；及陰離子性界面活性劑例如烷基磺酸鹽類、烷基苯磺酸鹽類及烷基硫酸鹽類。

調配物之其他輔劑之實例包含黏結劑、分散劑、著色劑及安定劑等，且其具體實例包含酪蛋白、明膠、多醣類(例如澱粉、阿拉伯膠、纖維素衍生物、藻酸等)、木質素衍生物、膨潤土、合成之水溶性聚合物(例如聚乙烯醇、聚乙烯吡咯啉酮、聚丙烯酸等)、PAP(酸式磷酸異丙酯(isopropyl acid phosphate))、BHT(2,6-二-第三丁基-4-甲基酚)及BHA(2-第三丁基-4-甲氧基酚與3-第三丁基-4-甲氧基酚之混合物)。

本發明之有害生物防治方法包括對有害生物或有害生物棲息地施用有效量之本發明化合物。

本發明之有害生物防治方法中，可使用本發明化合物之調配物替代本發明化合物。該調配物可施用至有害生物或有害生物棲息地。

有害生物之棲息地之例包括水田、耕地、果園、未耕作土地及房舍。

本發明化合物或其調配物對有害生物或有害生物棲息地之施用可藉由傳統方法達成，只要使有害生物接觸或

攝入本發明化合物即可。

該施用方法之實例包括噴灑處理、土壤處理、種子處理及水培養基處理。

本文所使用之噴灑處理意指包括以活性成分(亦即本發明化合物)處理植物表面或有害生物本身,以產生對有害生物之防治效果之處理方法。噴灑處理之具體實例包含葉部噴灑處理及莖幹噴灑處理。

土壤處理為包括以活性成分處理土壤或灌溉液體,目的在於使活性成分藉由植物的根部分等而滲透或轉移至欲保護免於受傷害(例如有害生物攝食)之作物之植物體內部,且因而可保護該作物免於有害生物的傷害之處理方法。土壤處理之具體實例包含植穴處理(planting hole treatment)(例如植穴噴灑、植穴處理後之土壤混合(soil incorporation))、植物根部(plant foot)處理(例如植物根部噴灑、於植物根部處理後之土壤混合、植物根部灌溉、於晚苗期之植物根部處理)、植溝(planting furrow)處理(例如植溝噴灑、於植溝處理後之土壤混合)、植行(planting row)處理(例如植行噴灑、於植行處理後之土壤混合、於生長期之植行噴灑)、於播種期(time of sowing)之植行處理(例如於播種期之植行噴灑、於播種期中於植行處理後之土壤混合)、綜合處理(broadcast treatment)(例如整個土壤表面噴灑、整個土壤混合)、其他土壤噴灑處理(例如於生長期之顆粒調配物的葉部噴灑、於植冠下或主莖周圍的噴灑、土壤表面噴灑、表面土壤混合、播種穴(seed

hole)噴灑、溝地表面噴灑、植物間噴灑)、其他灌藥(drenching)處理(例如土壤灌藥、育苗期之灌藥、化學注射處理、植物根部灌藥、化學滴水灌溉(drip irrigation)、化學灌溉(chemigation))、育苗箱處理(例如對育苗箱內噴灑、育苗箱之灌洗)、育苗盤處理(例如育苗盤噴灑、育苗盤灌洗)、種床(seedbed)處理(例如種床噴灑、種床灌洗、對低地水稻苗圃(nursery)噴灑、苗浸滲)、種床土壤混合處理(例如種床土壤混合、播種前之種床土壤混合)、以及其他處理(例如培養土混合、犁耕、表面土壤混合、植冠落雨滴處之土壤混合、植位處理、顆粒配方物對花簇處理、糊狀肥料之土壤混合)。

種子處理意指包括以活性成分直接處理欲保護免於傷害(例如有害生物之攝食)之作物之種子、種用塊莖或球莖或其附近，且因而可產生對有害生物之防治效果之處理方法。種子處理之具體實例包含噴灑處理、塗抹處理、浸滲處理、注入處理、塗覆處理、膜覆處理及小粒塗覆處理。

水培養基處理意指包括以活性成分處理水培養基等，目的在於使該活性成分藉由植物的根部分等而滲透或轉移至欲保護免於受傷害(例如有害生物攝食)之作物之植物體內部，且因而可保護該作物免於有害生物的傷害之處理方法。水培養基處理之具體實例包括與水培養基混合以及混入水培養基。

當本發明化合物於農業田間使用於有害生物防治時，其施用量對於每 $10,000\text{m}^2$ 通常為 1 至 $10,000\text{g}$ 。

當本發明化合物調配為乳化濃縮物、可濕性粉劑或可流動調配物時，該調配物通常以水稀釋使本發明化合物之濃度成為 0.01 至 10,000ppm 後予以施用。當本發明化合物調配為粒劑或粉劑時，該調配物通常以其原樣施用。

該調配物或其水稀釋物可直接噴灑至有害生物或例如欲保護免於有害生物傷害之作物的植物體。或者，可使用該調配物或其水稀釋物處理耕地之土壤以防治棲息於該土壤之有害生物。

本發明化合物之樹脂調配物可加工為片或線帶。該樹脂調配物可藉由將該樹脂調配物之片或線帶纏繞作物、將該樹脂調配物之線帶置放於作物附近而使得該作物為該線帶所圍繞、或將該樹脂調配物之片平放於靠近植物根部之土壤表面而施用。

當本發明化合物用於防治存活於屋舍之有害生物(例如蒼蠅、蚊子、蟑螂)時，其施用量於平面表面處理情況中對於每 1m^2 通常為 0.01 至 1,000 mg，而於空間處理情況中對於每 1m^3 通常為 0.01 至 500 mg。

當本發明化合物調配為乳化濃縮物、可濕性粉末或可流動調配物時，該調配物通常以水稀釋使本發明化合物之濃度成為 0.1 至 1,000ppm 後予以施用。當本發明化合物調配為油性製劑、氣霧調配物、煙燻劑或毒餌時，該調配物通常以其原樣施用。

本發明化合物可使用作為於農耕地，或非農耕地之農藥，該農耕地例如耕作地、稻田、草坪及果園。某些情況

中，本發明化合物可於培養下文所列舉植物(包括作物等)之農耕地防治有害生物，而不會對該作物造成藥物傷害。

農作物：玉米、稻、小麥、大麥、黑麥、燕麥、高粱、棉花、大豆、花生、蕎麥、甜菜、油菜籽、向日葵、甘蔗、菸草等；

蔬菜：茄科蔬菜(Solanaceae vegetables)(茄子、番茄、青椒、辣椒、馬鈴薯等)、葫蘆科蔬菜(Cucurbitaceae vegetables)(胡瓜、南瓜、美洲節瓜、西瓜、甜瓜等)、十字花科蔬菜(Cruciferae vegetables)(日本蘿蔔、蕪菁、辣根、球莖甘藍(kohlrabi)、中國甘藍菜、甘藍菜、黑芥(brown mustard)、青花菜、花椰菜等)、菊科蔬菜(Compositae vegetables)(牛蒡、茼蒿、朝鮮薊、萵苣等)、百合科蔬菜(Liliaceae vegetables)(蔥、洋蔥、蒜、蘆筍等)、繖形花科蔬菜(Umbelliferae vegetables)(胡蘿蔔、歐芹、芹菜、防風草(parsnip)等)、藜科蔬菜(Chenopodiaceae vegetables)(菠菜、瑞士甜菜(Swiss chard)等)、薄荷科蔬菜(Labiatae vegetables)(日本羅勒、薄荷、九層塔等)、草莓、蕃薯、山藥、芋(arioid)等；

花及觀賞植物(ornamental plants)；

觀葉植物(Foliage plant)；

果樹：仁果類(蘋果、普通梨木、日本梨、木瓜、榲桲(quince)等)、核果類(桃、李、油桃、日本李、櫻桃、杏、洋李等)、柑橘類植物(蜜柑(Satsuma mandarin)、柳橙、檸檬、萊姆、葡萄柚等)、堅果類(栗、胡桃、榛果、

杏仁、開心果、腰果、澳洲胡桃等)、漿果類(藍莓、蔓越莓、黑莓、覆盆子等)、葡萄、柿、橄欖、枇杷、香蕉、咖啡、棗、椰子等；

除了果樹以外之樹種：茶樹、桑樹、觀花樹木與灌木、行道樹(桉樹、樺樹、山茱萸、尤加利(eucalyptus)、銀杏、紫丁香、楓樹、橡樹、白楊樹、紫荊、楓香、梧桐、檉樹、日本側柏、冷杉、日本鐵杉、杜松、松樹、雲杉、紫杉)等。

前述作物包含對除草劑具有抗性之作物，該除草劑例如：HPPD 抑制劑如異噁唑草酮(isoxaflutole)、ALS 抑制劑如咪草煙(imazethapyr)或噻吩磺隆(thifensulfuron-methyl)、EPSP 合成酵素抑制劑、麩醯胺合成酵素抑制劑及溴苯肼(bromoxynil)。而該抗性係藉由典型育種方法或遺傳工程技術所提供。

藉由典型育種方法而對除草劑具有抗性之作物之實例包含對咪唑啉酮(imidazolinone)除草劑如咪草煙(imazethapyr)具有抗性之 Clearfield(註冊商標)菜籽(canola)、及對磺醯脲 ALS 抑制劑除草劑如噻吩磺隆具有抗性之 STS 大豆。

經由遺傳工程技術而對除草劑具有抗性之作物之實例包含對草甘膦(glyphosate)或固殺草(glufosinate)具有抗性之玉米栽培品種。一些上述玉米栽培品種係以 RoundupReady(註冊商標)、LibertyLink(註冊商標)等商品名販售。

前述作物包含經由遺傳工程技術而有能力產生殺蟲毒素之作物者，該殺蟲毒素為例如由芽孢桿菌(*Bacillus*)所產生之選擇性毒素。

由此等遺傳工程改造植物所產生的殺蟲毒素之實例包含由仙人掌桿菌(*Bacillus cereus*)及多黏芽孢桿菌(*Bacillus popilliae*)衍生之殺蟲蛋白；由蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)衍生之殺蟲蛋白，例如 δ -內毒素(例如 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 及 Cry9C)、VIP 1、VIP 2、VIP 3 及 VIP 3A；由線蟲衍生之殺蟲蛋白；由動物產生之毒素，例如蠍毒素、蜘蛛毒素、蜂毒素及昆蟲專一性神經毒素；真菌毒素；植物凝集素(lectin)；凝集素(agglutinin)；蛋白酶抑制劑，例如胰蛋白酶抑制劑、絲胺酸蛋白酶抑制劑、馬鈴薯塊莖儲藏蛋白抑制劑(patatin)、半胱胺酸蛋白酶抑制劑(cystatin)、及木瓜酵素(papain)抑制劑；核糖體去活性蛋白(RIP)，例如蓖麻毒素、玉米-RIP、相思子毒素(abrin)、皂草毒素蛋白(saporin)、及瀉根素(briodin)；類固醇代謝酵素，例如 3-羥基類固醇氧化酶、蛻皮類固醇-UDP-葡萄糖基轉移酶(ecdysteroid-UDP-glucosyltransferase)、及膽固醇氧化酶；蛻皮激素抑制劑；HMG-CoA 還原酶；離子通道抑制劑，例如鈉離子通道抑制劑及鈣離子通道抑制劑；青春激素酯酶；利尿激素受體；二苯乙烯合成酶；聯苜基合成酶；幾丁質酶；及葡聚糖酶。

由此等遺傳工程改造植物所產生的毒素亦包含殺蟲蛋白例如 δ -內毒素蛋白質(例如 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 及 Cry9C)、VIP 1、VIP 2、VIP 3 及 VIP 3A 之雜合毒素、部份失活毒素與經修飾毒素。雜合毒素係經由遺傳工程技術組合殺蟲蛋白之不同功能區(domain)所製得。部份失活毒素之實例包含 Cry1Ab，其中部分胺基酸已被刪除。經修飾毒素之實例包含天然毒素中的一個或多個胺基酸已被取代之毒素。

該殺蟲毒素及有能力產生殺蟲毒素之遺傳工程改造作物植物體係說明於，例如，EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451878、或 WO 03/052073。

有能力產生殺蟲毒素之遺傳工程改造作物植物體對於鞘翅目有害生物、雙翅目有害生物或鱗翅目有害生物的攻擊特別具有抗性。

亦知具有一種或多種有害生物抗性基因並因而能產生一種或多種殺蟲毒素之遺傳工程改造植物，且該等遺傳工程改造植物中有些為市售可得者。此等遺傳工程改造植物之實例包含 YieldGard(註冊商標)(表現 Cry1Ab 毒素之玉米栽培品種)、YieldGard Rootworm(註冊商標)(表現 Cry3Bb1 毒素之玉米栽培品種)、YieldGard Plus(註冊商標)(表現 Cry1Ab 及 Cry3Bb1 毒素之玉米栽培品種)、Heculex I(註冊商標)(表現 Cry1Fa2 毒素及草胺磷 N-乙醯基轉移酶(phosphinothricin N-acetyltransferase (PAT)))

而對固殺草(gluphosinate)具有抗性之玉米栽培品種)、NuCOTN33B(註冊商標)(表現 Cry1Ac 毒素之棉花栽培品種)、Bollgard I(註冊商標)(表現 Cry1Ac 毒素之棉花栽培品種)、Bollgard II(註冊商標)(表現 Cry1Ac 及 Cry2Ab 毒素之棉花栽培品種)、VIPCOT(註冊商標)(表現 VIP 毒素之棉花栽培品種)、NewLeaf(註冊商標)(表現 Cry3A 毒素之馬鈴薯栽培品種)、NatureGard Agrisure GT Advantage(註冊商標)(GA21 抗草甘膦特性(GA21 glyphosate-resistance character))、Agrisure CB Advantage(註冊商標)(Bt11 玉米螟蟲(CB)特性)、及 Protecta(註冊商標)。

前述作物植物體包含彼等經由遺傳工程技術而賦予產生抗病原菌物質之能力者。

該抗病原菌物質之實例包含 PR 蛋白(PRPs, 揭露於 EP-A-0 392 225); 離子通道抑制劑, 例如鈉離子通道抑制劑及鈣離子通道抑制劑(例如由病毒產生之 KP1、KP4、或 KP6 毒素); 二苯乙烯合成酶; 聯苄基合成酶; 幾丁質酶; 葡聚糖酶; 由微生物產生之物質, 例如肽類抗生素、含雜環抗生素、及與植物病害抗性有關的蛋白質因子(揭露於 WO 03/000906)。此等抗病原菌物質及可產生抗病原菌物質之遺傳工程改造植物係揭露於 EP-A-0 392 225、WO 05/33818、EP-A-0 353 191 等。

本發明之有害生物防治組成物可含有其他殺蟲劑、殺線蟲劑、殺蟎劑、殺真菌劑、除草劑、植物生長調節劑、

增效劑、肥料、土壤調理劑或動物飼料。

本發明化合物可與其他殺蟲劑、殺線蟲劑、殺蟎劑、殺真菌劑、植物激素劑、植物生長調節劑、除草劑、增效劑、藥物傷害舒緩劑、色素、肥料等混合製備經混合之調配物，而可使用於噴灑處理、土壤處理或水培養基處理。

此等殺蟲劑之活性成分之實例包含：

(1)有機磷化合物類：

毆殺松(acephate)、磷化鋁、丁硫松(butathiofos)、硫線磷(cadusafos)、氯氧磷(chlorethoxyfos)、克芬松(chlorfenvinphos)、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、氰乃松(cyanophos; CYAP)、大利松(diazinon)、二氯二異丙醚(dichlorodiisopropyl ether, DCIP)、酚線磷(dichlofenthion; ECP)、二氯松(dichlorvos; DDVP)、大滅松(dimethoate)、甲基毒蟲畏(dimethylvinphos)、二硫松(disulfoton)、EPN、愛殺松(ethion)、普伏松(ethoprophos)、益多松(etrimfos)、芬殺松(fenthion; MPP)、撲滅松(fenitrothion; MEP)、福賽絕(fosthiazate)、福木松(formothion)、磷化氫、亞芬松(isofenphos)、加福松(isoxathion)、馬拉松(malathion)、馬硫松(mesulfenfos)、滅大松(methidathion; DMTP)、亞素靈(monocrotophos)、二溴磷(naled; BRP)、異亞碲磷(oxydeprofos; ESP)、巴拉松(parathion)、裕必松(phosalone)、亞胺硫磷(phosmet; PMP)、甲基嘧啶磷(pirimiphos-methyl)、嗒硫磷

(pyridafenthion)、喹硫磷(quinalphos)、賽達松
(phenthoate; PAP)、佈飛松(profenofos)、丙蟲磷
(propaphos)、普硫松(prothiofos)、白克松(pyraclofos)、
蔬果磷(salithion)、硫丙磷(sulprofos)、丁基嘧啶磷
(tebupirimfos)、雙硫磷(temephos)、殺蟲畏
(tetrachlorvinphos)、托福松(terbufos)、硫滅松
(thiometon)、三氯松(trichlorphon; DEP)、繁米松
(vamidothion)等；

(2) 胺基甲酸酯化合物類：

棉鈴成(alanycarb)、免敵克(bendiocarb)、免扶克
(benfuracarb)、BPMC、加保利(carbaryl)、克百威
(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、地蟲威
(cloethocarb)、乙硫苯威(ethiofencarb)、仲丁威
(fenobucarb)、芬硫克(fenothiocarb)、芬諾克
(fenoxycarb)、呋線威(furathiocarb)、異丙威
(isoprocab; MIPC)、速滅威(metolcarb)、納乃得
(methomyl)、滅賜克(methiocarb)、NAC、毆殺滅(oxamyl)、
抗芽威(pirimicarb)、安丹(propoxur; PHC)、XMC、硫雙
威(thiodicarb)、滅殺威(xylylcarb)等；

(3) 合成性除蟲菊精(pyrethroid)化合物類：

阿納寧(acrinathrin)、亞列寧(allethrin)、拜富寧
(benfluthrin)、 β -賽扶寧(beta-cyfluthrin)、畢芬寧
(bifenthrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、賽扶寧
(cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、賽滅寧

(cypermethrin)、第滅寧(deltamethrin)、益化利(esfenvalerate)、醚菊酯(ethofenprox)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、護賽寧(flucythrinate)、伏芬普斯(flufenoprox)、氟氯苯菊酯(flumethrin)、福化利(fluvalinate)、合芬寧(halfenprox)、益普靈(imiprothrin)、百滅寧(permethrin)、普亞列寧(prallethrin)、除蟲菊酯(pyrethrins)、異列滅寧(resmethrin)、 σ -賽滅寧(sigma-cypermethrin)、矽護芬(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、泰滅寧(tralomethrin)、四氟苯菊酯(transfluthrin)、(EZ)-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2,2-二甲基-3-丙-1-烯基環丙烷羧酸 2,3,5,6-四氟-4-(甲基)苯甲酯、(EZ)-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2,2-二甲基-3-丙-1-烯基環丙烷羧酸 2,3,5,6-四氟-4-(甲基)苯甲酯、及(EZ)-(1RS, 3RS; 1RS, 3SR)-2,2-二甲基-3-(2-甲基-1-丙烯基)環丙烷羧酸 2,3,5,6-四氟-4-(甲氧基(甲基))苯甲酯等；

(4)沙蠶毒素(nereistoxin)化合物類：

培丹(cartap)、免速達(bensultap)、殺蟲環(thiocyclam)、殺蟲單(monosultap)、殺蟲雙(bisultap)等；

(5)新類尼古丁(neonicotinoid)化合物類：

益達胺(imidacloprid)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、亞滅培(acetamiprid)、噻蟲嗪(thiamethoxam)、噻蟲啉

(thiacloprid)、達特南(dinotefuran)、可尼丁(clothianidin)等；

(6) 苯甲醯基脲化合物類：

克福隆(chlorfluazuron)、雙三氟蟲脲(bistrifluron)、汰芬隆(diafenthiuron)、除蟲脲(di-flubenzuron)、氟啶蟬脲(flucyloxuron)、氟環脲(flucyloxuron)、氟芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、祿芬隆(lufenuron)、諾伐隆(novaluron)、多氟蟲醯脲(noviflumuron)、得福隆(teflubenzuron)、殺鈴脲(triflumuron)等；

(7) 苯基吡唑化合物類：

乙醯蟲肼(acetoprole)、乙蟲清(ethiprole)、芬普尼(fipronil)、吡咯胺(vaniliprole)、氟蟲肼(pyriprole)、丁烯氟蟲肼(pyrafluprole)等；

(8) Bt 毒素殺蟲劑：

來自蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)之活孢子或由蘇力菌所產生之結晶毒素，及其混合物；

(9) 肼化合物類：

可芬諾(chromafenozide)、氟蟲醯肼(halofenozide)、滅芬諾(methoxyfenozide)、抑蟲肼(tebufenozide)等；

(10) 有機氯化合物類：

阿特靈(aldrin)、地特靈(dieldrin)、除蟎靈(dienochlor)、硫丹(endosulfan)、甲氧基氯

(methoxychlor)等；

(11)天然殺蟲劑：

機油、菸鹼硫酸鹽；

(12)其他殺蟲劑：

阿維菌素-B(avermectin-B)、溴蟎酯

(bromopropylate)、布芬淨(buprofezin)、溴蟲清

(chlorphenapyr)、滅蠅胺(cyromazine)、D-D(1,3-二氯丙

烯)、因滅丁(emamectin-benzoate)、芬殺蟎(fenazaquin)、

吡氟硫磷(flupyrzofos)、烯蟲乙酯(hydroprene)、因得

克(indoxacarb)、噁蟲酮(metoxadiazone)、倍脈心-A

(milbemycin-A)、派滅淨(pymetrozine)、啖蟲丙醚

(pyridalyl)、百利普芬(pyriproxyfen)、賜諾殺

(spinosad)、氟蟲胺(sulfluramid)、唑蟲醯胺

(tolfenpyrad)、唑蚜威(triazamate)、氟蟲醯胺

(flubendiamide)、SI-0009、丁氟蟎酯(cyflumetofen)、

砷酸(arsenic acid)、苯克賽(benclothiaz)、氰胺化鈣、

多硫化鈣(calcium polysulfide)、可氯丹(chlordane)、

DDT、DSP、伏芬靈(flufenimer)、氟尼胺(flonicamid)、

氟蟲芬(flurimfen)、覆滅蟎(formetanate)、安百畝

(metam-ammonium)、威百畝(metam-sodium)、溴化甲烷、

泥第替夫(nidinotefuran)、油酸鉀、普奇芬

(protrifenbute)、螺甲蟎酯(spiromesifen)、硫、氟氟蟲

脞(metaflumizone)、螺蟲乙酯(spirotetramat)等。

殺蟎劑之活性成分之實例包含亞醯蟎(acequinocyl)、

三亞蟎(amitraz)、苯蟎特(benzoximate)、溴蟎酯(bromopropylate)、蟎離丹(chinomethionat)、克氯苯(chlorobenzilate)、殺蟎酯(chlorfenson, CPCBS)、四蟎嗪(clofentezine)、開樂散(kelthane)(大克蟎(dicofol))、依殺蟎(etoxazole)、芬佈賜(fenbutatin oxide)、芬硫克(fenothiocarb)、芬普蟎(fenpyroximate)、嘧蟎酯(flucacrypyrim)、苜蟎醚(fluproxyfen)、合賽多(hexythiazox)、毆蟎多(propargite; BPPS)、瀏陽黴素(polynactins)、畢達本(pyridaben)、畢汰芬(pyrimidifen)、吡蟎胺(tebufenpyrad)、三氯殺蟎砒(tetradifon)、季酮蟎酯(spirodiclofen)、安伏滅(amidoflumet)、聯苯聯酯(bifenazate)及氰普凡(cyenopyrafen)等。

殺線蟲劑之活性成分之實例包括 DCIP、福賽絕(fosthiazate)、左美索(levamisol)、甲基異硫氰酸酯及摩朗得酒石酸鹽(morantel tartarate)等。

實施例

後文中，將藉由下列製備例、調配例及試驗例更詳細說明本發明。但本發明並不限於該等實施例。

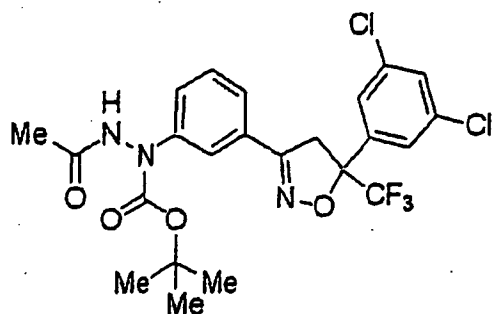
首先，呈示本發明之化合物之製備例。

製備例 1

對 1.39g 之後文所述之參考製備例 6 所獲得化合物及 330mg 之三乙胺於 12ml 四氫呋喃之溶液，於 0°C 滴加 257mg 之乙醯氯，接著於 0°C 攪拌 1 小時候於室溫靜置 13 小時。

對反應混合物添加水，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。所得殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 1.30g 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(1))。

本發明化合物(1)

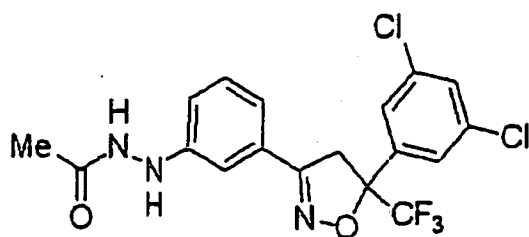


熔點:111°C

製備例 2

於室溫，對 250mg 之本發明化合物(1)之 1ml 四氫呋喃之溶液，滴加 1.5mL 三氟乙酸，接著攪拌 1 小時。對反應混合物添加飽和碳酸氫鈉水溶液，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 179mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(2))。

本發明化合物(2)

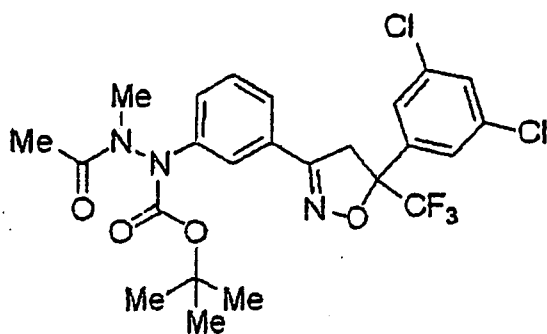


熔點:100°C

製備例 3

於室溫，對 78mg 之氫化鈉(60%油中)於 4mL 四氫呋喃之懸浮物，滴加 800mg 之本發明化合物(1)於 6mL 四氫呋喃之溶液。於相同溫度攪拌 30 分鐘後，於室溫對其添加 355mg 之碘甲烷，接著於相同溫度攪拌 10 小時。對該混合物添加飽和碳酸氫鈉水溶液，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 697mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(3))。

本發明化合物(3)

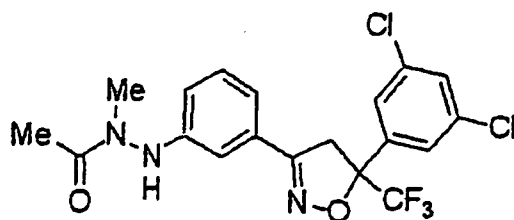


熔點: 79°C

製備例 4

於室溫，對 324mg 之本發明化合物(3)添加 5mL 三氟乙酸，接著於相同溫度攪拌 30 分鐘。減壓濃縮反應混合物且對殘餘物添加乙酸乙酯。有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 290mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(4))。

本發明化合物(4)

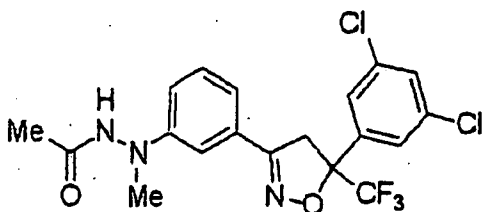


熔點: 88°C

製備例 5

於 0°C ，對 1.00g 之後文所述參考製備例 10 所獲得粗製化合物與 180mg 之三乙胺於 3mL 四氫呋喃之溶液，滴加 139mg 之乙醯氯，接著於相同溫度攪拌 1 小時。對反應混合物添加飽和碳酸氫鈉水溶液，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 498mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(5))。

本發明化合物(5)



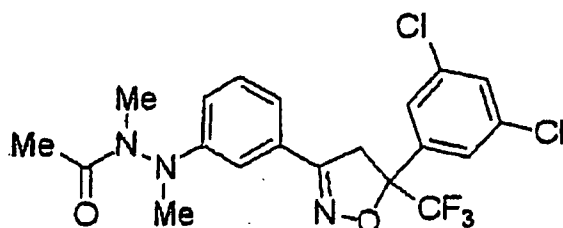
熔點: 87°C

製備例 6

於室溫，248mg 之本發明化合物(5) 於 2mL N,N-二甲基甲醯胺之溶液添加 92mg 之碳酸鈉與 87mg 之碘甲烷。於相同溫度攪拌 5 小時後，對其添加 20mL 第三丁基甲基醚且過濾沉澱。濾液減壓濃縮，且殘餘物進行矽膠管柱層析而

獲得 140mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(6))。

本發明化合物(6)

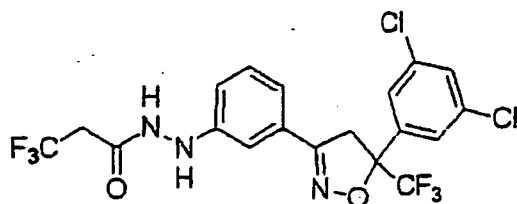


熔點:151°C

製備例 7

於 0°C，對 1.04 g 之後文所述參考製備例 3 所獲得粗製化合物與 269mg 之三乙胺於 5mL 四氫呋喃之溶液，滴加 391mg 之 3,3,3-三氟丙醯氯，接著於室溫攪拌 4 小時。對反應混合物添加飽和碳酸氫鈉水溶液，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 639mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(7))。

本發明化合物(7)



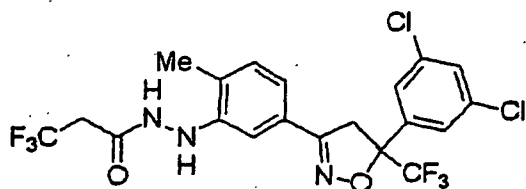
熔點:75°C

製備例 8

於 0°C，對 220mg 之後文所述參考製備例 14 所獲得粗製化合物與 43mg 之吡啶於 2mL 乙酸乙酯之溶液，滴加 80mg

之 3,3,3-三氟丙醯氯，接著於室溫攪拌 4 小時。對反應混合物添加水，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 162mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(8))。

本發明化合物(8)

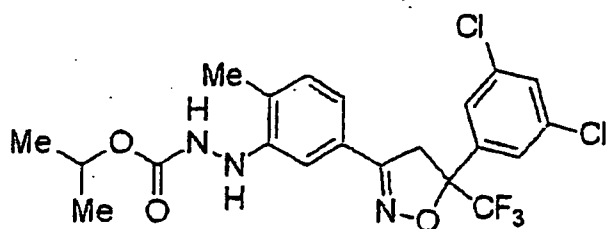


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.01-7.96 (1H, br m), 7.48-7.42 (3H, m), 7.15-7.04 (3H, m), 6.11-6.00 (1H, m), 4.04-4.00 (1H, m), 3.63 (1H, d, $J = 17.1$ Hz), 3.25-3.19 (2H, m), 2.26 (3H, s).

製備例 9

於 0°C ，對 220mg 之後文所述參考製備例 14 所獲得粗製化合物與 43mg 之吡啶於 2mL 乙酸乙酯之溶液，滴加 80mg 之氯甲酸異丙酯，接著於室溫攪拌 4 小時。對反應混合物添加水，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 127mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(9))。

本發明化合物(9)

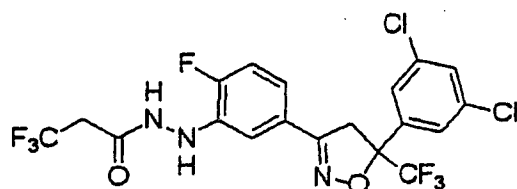


熔點: 71°C

製備例 10

於 0℃，對 412mg 之後文所述參考製備例 18 所獲得粗製化合物與 102mg 之三乙胺於 6mL 四氫呋喃之溶液，滴加 148mg 之 3,3,3-三氟丙醯氯，接著於室溫攪拌 4 小時。對反應混合物添加飽和碳酸氫鈉水溶液，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 167mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(10))。

本發明化合物(10)

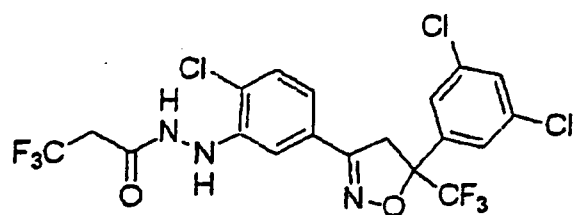


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.89-7.55 (1H, m), 7.46-7.42 (3H, m), 7.28 (1H, dd, $J = 7.9, 1.8$ Hz), 7.18-7.00 (2H, m), 6.39-6.29 (1H, m), 4.03-3.98 (1H, m), 3.65-3.60 (1H, m), 3.21 (2H, q, $J = 10.3$ Hz).

製備例 11

於 0℃，對 510mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物與 123mg 之三乙胺於 6mL 四氫呋喃之溶液，滴加 179mg 之 3,3,3-三氟丙醯氯，接著於室溫攪拌 2.5 小時。對反應混合物添加飽和碳酸氫鈉水溶液，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 175mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(11))。

本發明化合物(11)

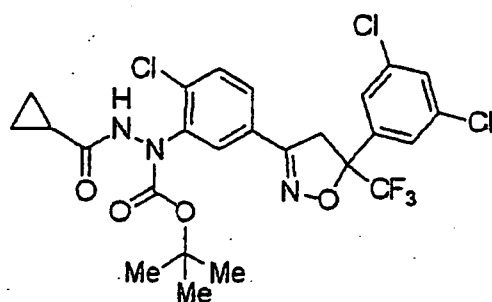


熔點: 89°C

製備例 12

於 0°C，對 110mg 之後文所述參考製備例 23 所獲得化合物與 22mg 之三乙胺於 2mL 四氫呋喃之溶液，滴加 23mg 之環丙烷羰基氯，接著於室溫攪拌 1 小時。對反應混合物添加水，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 101mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(12))。

本發明化合物(12)



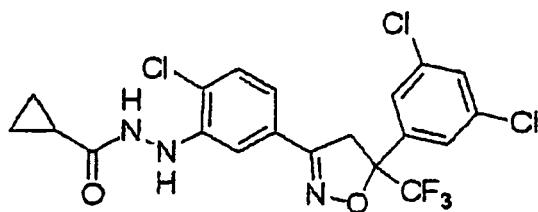
熔點: 180°C

製備例 13

於室溫，對 272mg 之本發明化合物(12)添加 2mL 三氟乙酸，接著於相同溫度攪拌 1 小時。減壓濃縮反應混合物且對殘餘物添加乙酸乙酯。有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 214mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為

本發明化合物(13))。

本發明化合物(13)

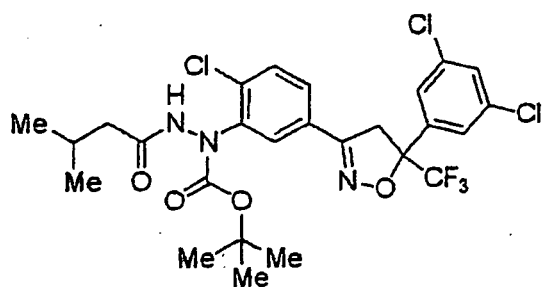


熔點:100°C

製備例 14

於 0°C，對 262mg 之後文所述參考製備例 23 所獲得化合物與 61mg 之三乙胺於 2mL 四氫呋喃之溶液，滴加 72mg 之異戊醯氯，接著於室溫攪拌 9 小時。對反應混合物添加水，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 280mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(14))。

本發明化合物(14)



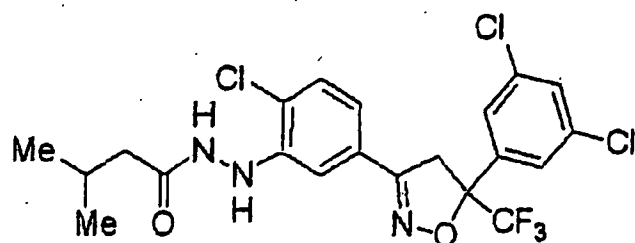
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.82-7.70 (3H, m), 7.48-7.44 (4H, m), 4.08-4.04 (1H, m), 3.71-3.66 (1H, m), 2.18-2.10 (3H, m), 1.45 (9H, d, J = 52.9 Hz), 0.98 (6H, d, J = 6.1 Hz).

製備例 15

於室溫，對 280mg 之本發明化合物 (14) 添加 2mL 三

氟乙酸，接著於相同溫度攪拌 2 小時。減壓濃縮反應混合物且對殘餘物添加乙酸乙酯。有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 222mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(15))。

本發明化合物(15)

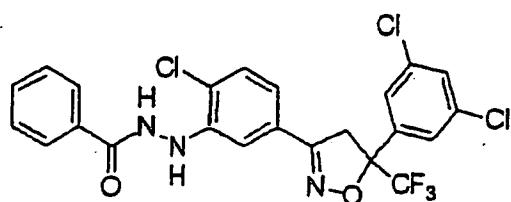


熔點:84°C

製備例 16

於 0°C，對 200mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物與 57mg 之三乙胺於 1.5mL 四氫呋喃之溶液，滴加 79mg 之苯甲醯氯，接著於室溫攪拌 2 小時。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 220mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(16))。

本發明化合物(16)



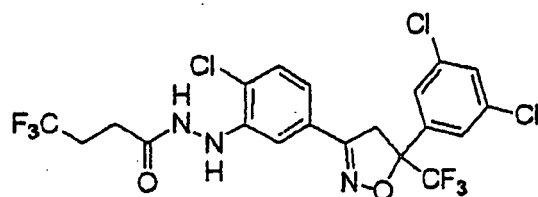
熔點:105°C

製備例 17

於 0°C，對 200mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得

粗製化合物與 57mg 之三乙胺於 2mL 四氫呋喃之溶液，滴加 90mg 之 4, 4, 4-三氟丁醯氯，接著於室溫攪拌 2 小時。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 201mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(17))。

本發明化合物(17)

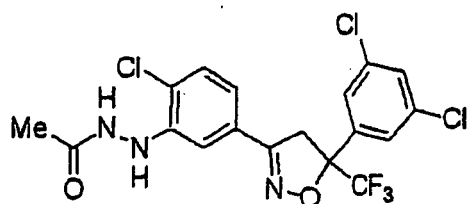


熔點: 82°C

製備例 18

於 0°C，對 200mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物與 57mg 之三乙胺於 4mL 四氫呋喃之溶液，滴加 44mg 之乙醯氯，接著於室溫攪拌 2 小時。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 168mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(18))。

本發明化合物(18)



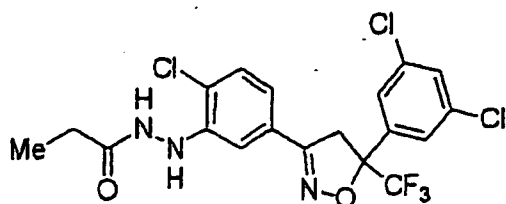
熔點: 94°C

製備例 19

於 0°C，對 200mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物與 57mg 之三乙胺於 4mL 四氫呋喃之溶液，滴加 52mg 之丙醯氯，接著於室溫攪拌 2 小時。反應混合物減壓

濃縮且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 195mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(19))。

本發明化合物(19)

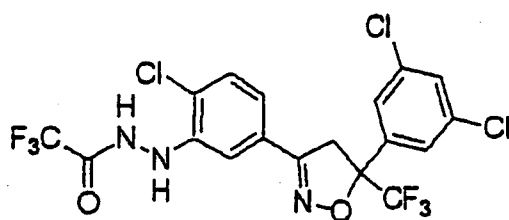


熔點: 92°C

製備例 20

於 0°C，對 260mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物與 60mg 之三乙胺於 2mL 四氫呋喃之溶液，滴加 150mg 之三氟乙酸酐，接著於室溫攪拌 2 小時。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 175mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(20))。

本發明化合物(20)



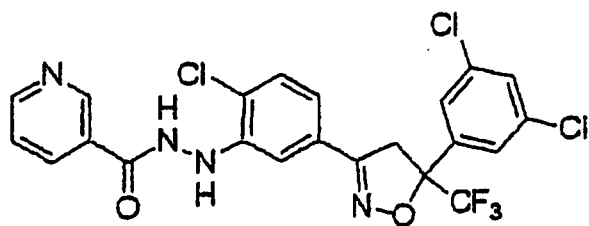
熔點: 64°C

製備例 21

於 0°C，對 200mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物與 95mg 之三乙胺於 4mL 四氫呋喃之溶液，添加 84mg 之菸鹼鹽氣鹽酸鹽，接著於室溫攪拌 2 小時。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 198mg 之

下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(21))。

本發明化合物(21)

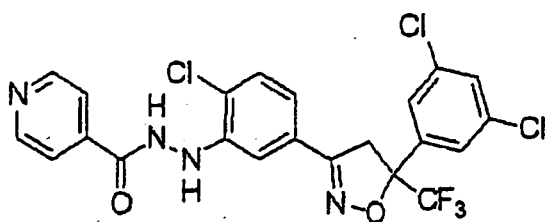


熔點:205°C

製備例 22

於 0°C，對 200mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物與 95mg 之三乙胺於 4mL 四氫呋喃之溶液，添加 84mg 之異菸鹼鹽酸鹽，接著於室溫攪拌 2 小時。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 169mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(22))。

本發明化合物(22)



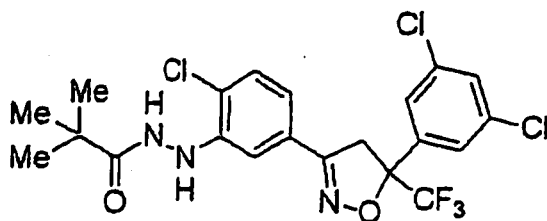
熔點:115°C

製備例 23

於 0°C，對 200mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物與 52mg 之三乙胺於 4mL 四氫呋喃添之溶液，添加 62mg 之三甲基乙醯氯，接著於室溫攪拌 2 小時。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 198mg 之

下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(23))。

本發明化合物(23)

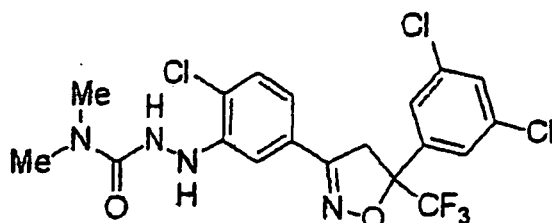


熔點:106°C

製備例 24

於 0°C，對 200mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物與 57mg 之三乙胺於 4mL 四氫呋喃之溶液，添加 67mg 之二甲基胺甲醯基氯，接著於室溫攪拌 2 小時。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 70mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(24))。

本發明化合物(24)



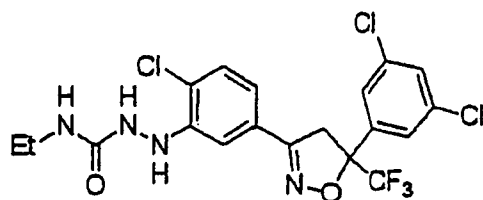
熔點:212°C

製備例 25

於 0°C，對 200mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物與 51mg 之三乙胺於 4mL 四氫呋喃之溶液，添加 37mg 之異氰酸乙酯，接著於室溫攪拌 2 小時。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 149mg 之下式

所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(25))。

本發明化合物(25)

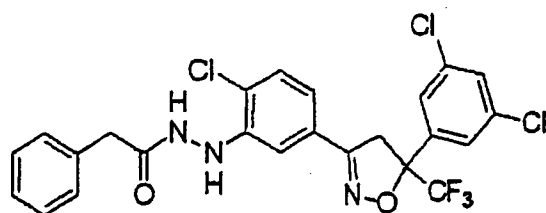


熔點:102°C

製備例 26

於 0°C，對 200mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物與 57mg 之三乙胺於 4mL 四氫呋喃之溶液，添加 79mg 之苯基乙醯氯，接著於室溫攪拌 2 小時。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 211mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(26))。

本發明化合物(26)



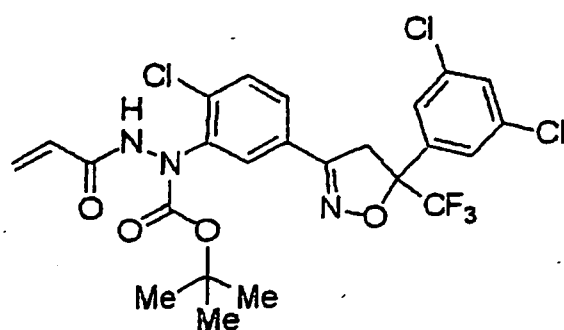
熔點:173°C

製備例 27

於室溫，對 500mg 之後文所述參考製備例 23 所獲得化合物與 122mg 之丙烯酸於 2mL N,N-二甲基甲醯胺之溶液，添加 319mg 之 1-乙基-3-(3-二甲基胺基丙基)碳二醯亞胺鹽酸鹽，接著攪拌 3 小時。對反應混合物添加水，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 384mg 之下式所表示

之化合物(後文中稱為本發明化合物(27))。

本發明化合物(27)

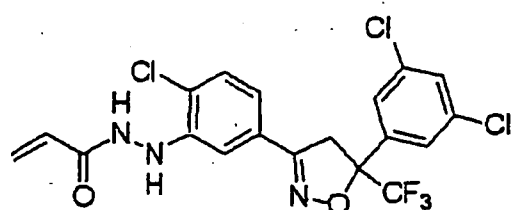


熔點:119°C

製備例 28

於室溫，對 309mg 之製備例 27 所獲得化合物，添加 2mL 三氟乙酸，接著於相同溫度攪拌 2 小時，減壓濃縮反應混合物且對殘餘物添加乙酸乙酯。有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 238mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(28))。

本發明化合物(28)



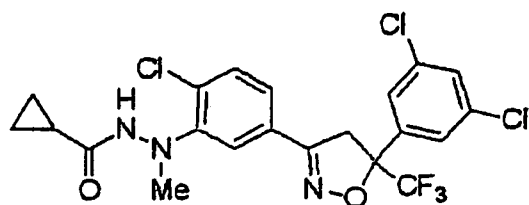
熔點:90°C

製備例 29

於室溫，對 200mg 之後文所述參考製備例 28 所獲得化合物與 57mg 之三乙胺於 2.0mL 四氫呋喃之溶液，滴加 58mg 之環丙烷甲醯氯，接著於相同溫度攪拌 30 分鐘。

反應混合物減壓濃縮且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 225mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(29))。

本發明化合物 (29)

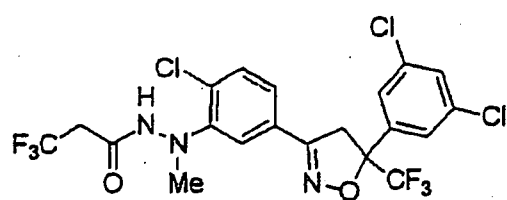


熔點:176°C

製備例 30

於室溫，對 200mg 之後文所述參考製備例 28 所獲得化合物與 57mg 之三乙胺於 2.0mL 四氫呋喃之溶液，滴加 81mg 之 3,3,3-三氟丙醯氯，接著於相同溫度攪拌 30 分鐘。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 241mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(30))。

本發明化合物(30)



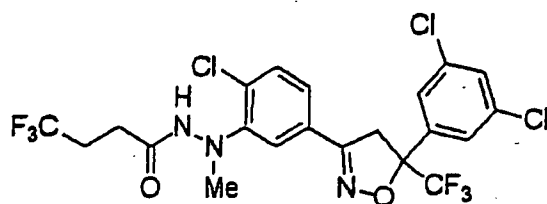
熔點:81°C

製備例 31

於室溫，對 200mg 之後文所述參考製備例 28 所獲得化合物與 57mg 之三乙胺於 2.0mL 四氫呋喃之溶液，滴加 88mg 之 4,4,4-三氟丁醯氯，接著於相同溫度攪拌 1 小時。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得

258mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(31))。

本發明化合物(31)

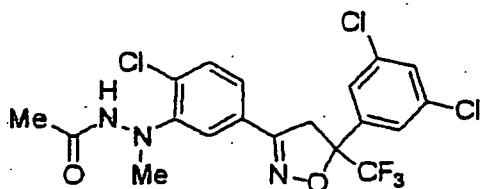


熔點: 77°C

製備例 32

於室溫，對 200mg 之後文所述參考製備例 28 所獲得化合物與 57mg 之三乙胺於 2.0mL 四氫呋喃之溶液，滴加 43mg 之乙醯氯，接著於相同溫度攪拌 1 小時。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 204mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(32))。

本發明化合物(32)



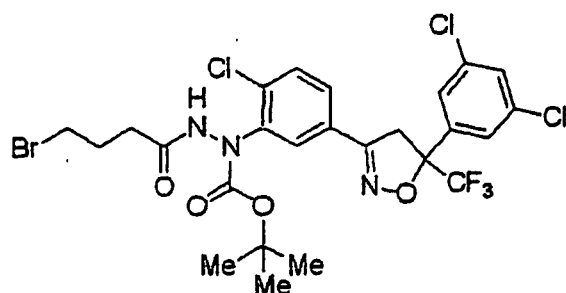
$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.88-7.24 (7H, m), 4.09-4.04 (1H, m), 3.70-3.66 (1H, m), 3.29-3.07 (3H, m), 2.17-1.91 (3H, m).

製備例 33

於室溫，對 525mg 之後文所述參考製備例 23 所獲得化合物與 121mg 之三乙胺於 4mL 四氫呋喃之溶液，滴加 223mg 之 4-溴丁醯基氯，接著攪拌 1 小時。對反應混合物添加水，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水

後減壓濃縮而獲得 699mg 之下式所表示之粗製化合物(後文中稱為本發明化合物(33))。

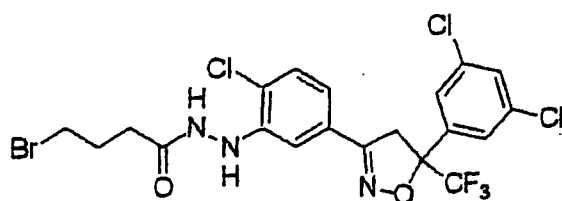
本發明化合物(33)



製備例 34

對 309mg 之本發明化合物(33)添加 2mL 三氟乙酸，接著於室溫攪拌 2 小時。減壓濃縮反應混合物且對殘餘物添加乙酸乙酯。有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 573mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(34))。

本發明化合物(34)



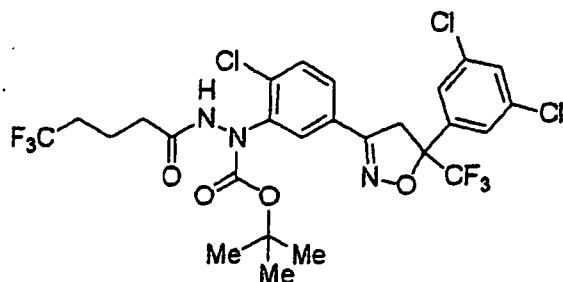
熔點: 59°C

製備例 35

於室溫，對 350mg 之後文所述參考製備例 23 所獲得化合物與 187mg 之 5, 5, 5-三氟戊酸於 2mL N, N-二甲基甲醯胺之溶液，添加 153mg 之 1-乙基-3-(3-二甲基胺基丙基)碳二醯亞胺鹽酸鹽，接著攪拌 3 小時。對反應混合物添加水，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減

壓濃縮而獲得 350mg 之下式所表示之粗製化合物(後文中稱為本發明化合物(35))。

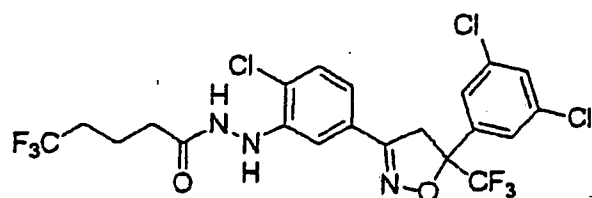
本發明化合物(35)



製備例 36

於室溫，對 350mg 之本發明化合物(35)添加 2mL 三氟乙酸，接著於相同溫度攪拌 2 小時。減壓濃縮反應混合物且對殘餘物添加乙酸乙酯。有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 269mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(36))。

本發明化合物(36)



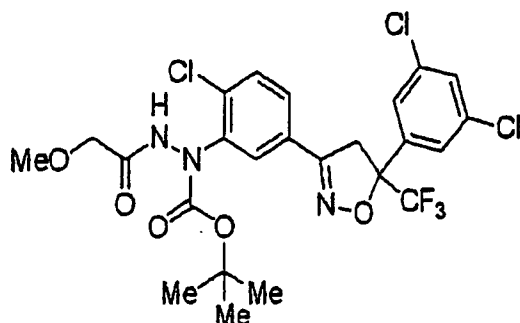
熔點: 163°C

製備例 37

於室溫，對 367mg 之後文所述參考製備例 23 所獲得化合物與 84mg 之三乙胺於 2mL 四氫呋喃之溶液，滴加 91mg 之甲氧基乙醯氯，接著攪拌 1 小時。對反應混合物添加乙酸乙酯。有機層以水清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮

而獲得 377mg 之下式所表示之粗製化合物(後文中稱為本發明化合物(37))。

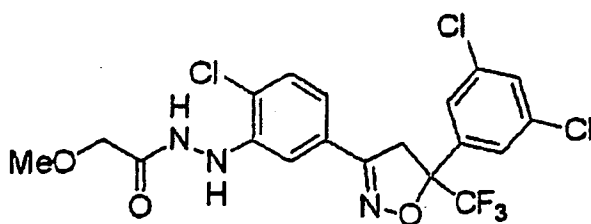
本發明化合物 (37)



製備例 38

於室溫，對 309mg 之粗製本發明化合物(37)添加 2mL 三氟乙酸，接著於相同溫度攪拌 2 小時。減壓濃縮反應混合物且將乙酸乙酯添加至殘餘物。有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 276mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(38))。

本發明化合物(38)



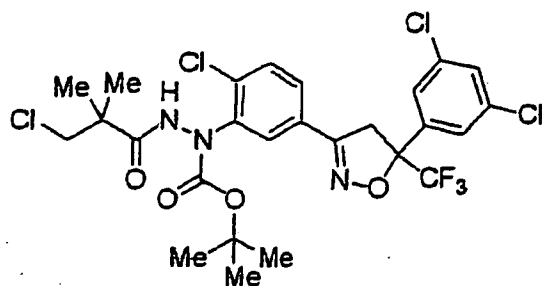
熔點: 178°C

製備例 39

於室溫，對 524mg 之後文所述參考製備例 23 所獲得化合物與 12.1mg 之三乙胺於 4mL 四氫呋喃之溶液，滴加

186mg 之 3-氯三甲基乙醯氯，接著於相同溫度攪拌 1 小時。對反應混合物添加乙酸乙酯。有機層以水清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 643mg 之下式所表示之粗製化合物(後文中稱為本發明化合物(39))。

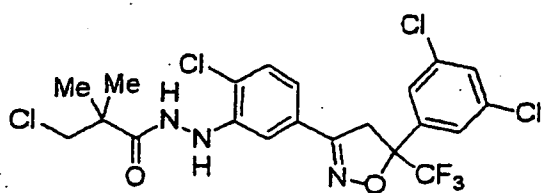
本發明化合物(39)



製備例 40

對 643mg 之粗製本發明化合物(39)添加 5mL 三氟乙酸，接著於室溫攪拌 2 小時。減壓濃縮反應混合物且對殘餘物添加乙酸乙酯。有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 520mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(40))。

本發明化合物(40)

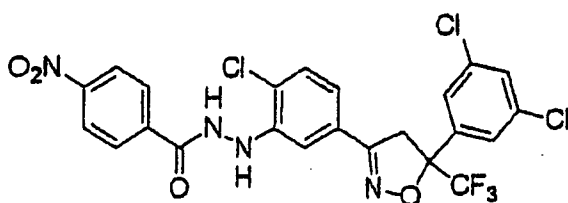


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.68 (1H, d, $J = 3.2$ Hz), 7.47 (2H, d, $J = 1.7$ Hz), 7.42 (1H, t, $J = 2.0$ Hz), 7.32 (1H, d, $J = 8.3$ Hz), 7.26 (1H, d, $J = 1.5$ Hz), 7.06 (1H, dd, $J = 8.2, 2.1$ Hz), 6.45 (1H, d, $J = 3.2$ Hz), 4.00 (1H, d, $J = 17.6$ Hz), 3.68 (2H, s), 3.63 (1H, d, $J = 17.6$ Hz), 1.42 (3H, s), 1.41 (3H, s).

製備例 41

於 0°C，對 200mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物與 56mg 之三乙胺於 4mL 四氫呋喃之溶液，添加 103mg 之 4-硝基苯甲醯氯，接著於室溫攪拌 10 分鐘。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 166mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(41))。

本發明化合物(41)

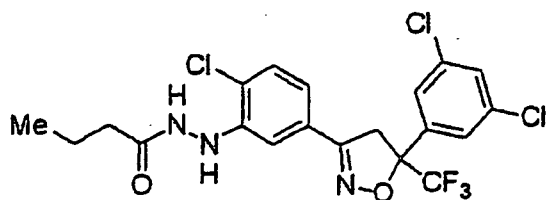


熔點: 231°C

製備例 42

於 0°C，對 200mg 之參考製備例 21 所獲得粗製化合物與 57mg 之三乙胺於 4mL 四氫呋喃之溶液添加 50mg 之丁醯氯，接著於室溫攪拌 20 分鐘。反應混合物減壓濃縮且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 121mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(42))。

本發明化合物(42)

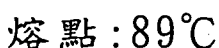


熔點: 82°C

製備例 43

於 0°C，對 200mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得

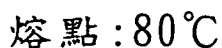
本發明化合物(43)



製備例 44

於 0°C，對 200mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物與 57mg 之三乙胺於 4mL 四氫呋喃之溶液，添加 63mg 之己醯氯，接著於室溫攪拌 20 分鐘。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 134mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(44))。

本發明化合物(44)

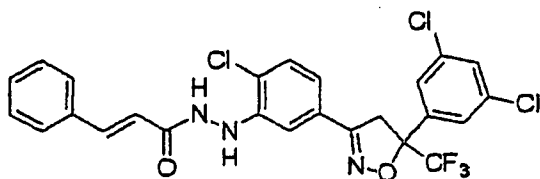


製備例 45

於 0℃，對 200mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得之粗製化合物與 57mg 之三乙胺於 4mL 四氫呋喃之溶液，添加 78mg 之肉桂醯氯，接著於室溫攪拌 20 分鐘。減壓濃縮

反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 161mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(45))。

本發明化合物(45)

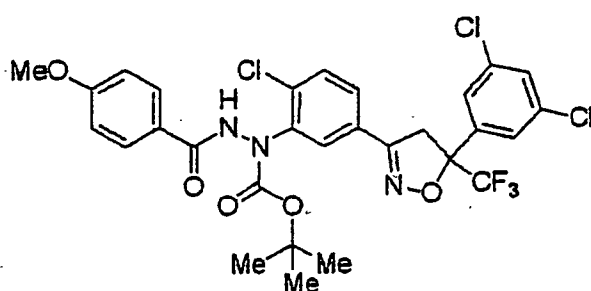


熔點: 205°C

製備例 46

於室溫，對 247mg 之後文所述參考製備例 23 所獲得化合物與 56mg 之三乙胺於 2mL 四氫呋喃之溶液，添加 95mg 之 4-甲氧基苯甲醯氯，接著攪拌小時。對反應混合物添加乙酸乙酯。有機層以水清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 240mg 之下式所表示之粗製化合物(後文中稱為本發明化合物(46))。

本發明化合物(46)

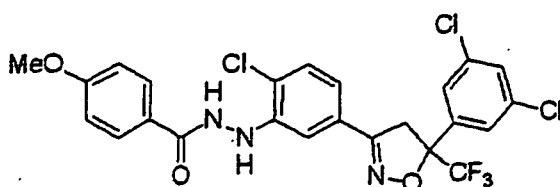


製備例 47

對 240mg 之本發明化合物(46)添加 2mL 三氟乙酸，接著於室溫攪拌 1 小時。減壓濃縮反應混合物且對殘餘物添加乙酸乙酯。有機層以飽和碳酸氫鈉水溶液清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 221mg 之下式所表示之化合

物(後文中稱為本發明化合物(47))。

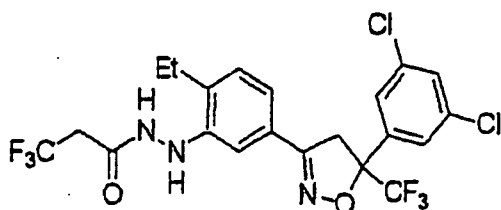
本發明化合物(47)



熔點:131°C

製備例 48

於室溫，對 1.31g 之後文所述參考製備例 31 所獲得化合物與 200mg 之三乙胺於 4mL 四氫呋喃之溶液，滴加 290mg 之 3,3,3-三氟丙醯氯，接著於相同溫度攪拌 1 小時。減壓濃縮反應混合物且殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 426mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(48))。本發明化合物(48)

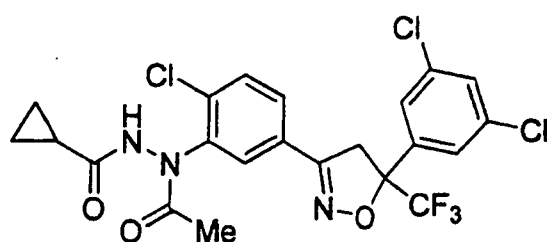


熔點:138.7°C

製備例 49

於室溫，對 200mg 之後文所述參考製備例 33 所獲得化合物與 65mg 之三乙胺於 2mL 四氫呋喃之溶液，滴加 54mg 之環丙烷甲醯氯，接著於相同溫度攪拌 1 小時。對反應混合物添加乙酸乙酯。有機層以水清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 216mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(49))。

本發明化合物(49)

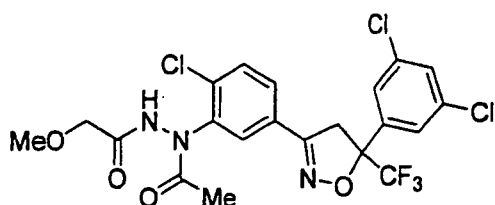


熔點:160°C

製備例 50

於室溫，對 200mg 之後文所述參考製備例 33 所獲得化合物與 65mg 之三乙胺於 2mL 四氫呋喃之溶液，滴加 55mg 之甲氧基乙醯氯，接著於相同溫度攪拌 1 小時。對反應混合物添加乙酸乙酯。有機層以水清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 130mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(50))。

本發明化合物 (50)



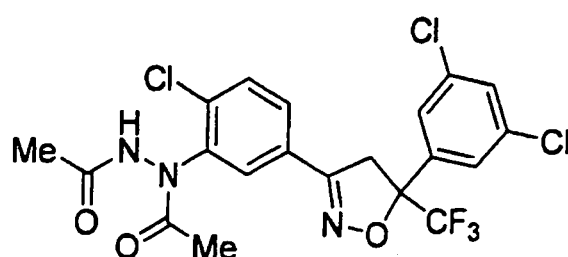
熔點:164°C

製備例 51

於室溫，對 200mg 之後文所述參考製備例 33 所獲得化合物與 65mg 之三乙胺於 2mL 四氫呋喃之溶液，滴加 40mg 之乙醯氯，接著於相同溫度攪拌 1 小時。對反應混合物添加乙酸乙酯。有機層以水清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 140mg 之下式所表

示之化合物(後文中稱為本發明化合物(51))。

本發明化合物(51)

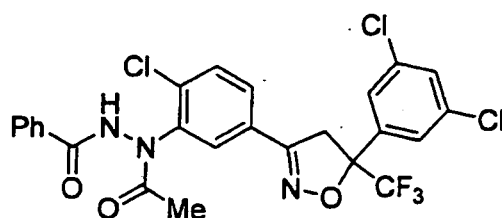


熔點:108°C

製備例 52

於室溫，對 200mg 之後文所述參考製備例 33 所獲得化合物與 65mg 之三乙胺於 2mL 四氫呋喃之溶液，滴加 72mg 之苯甲醯氯，接著於相同溫度攪拌 1 小時。對反應混合物添加乙酸乙酯。有機層以水清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 281mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(52))。

本發明化合物(52)

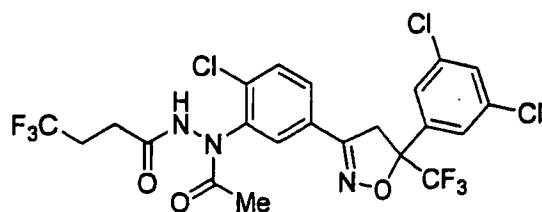


熔點:107°C

製備例 53

於室溫，對 200mg 之後文所述參考製備例 33 所獲得化合物與 65mg 之三乙胺於 2mL 四氫呋喃之溶液，滴加 90mg 之 4,4,4-三氟丁醯氯，接著於相同溫度攪拌 1 小時。對反應混合物添加乙酸乙酯。有機層以水清洗，於無水硫酸鈉

脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 207mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(53))。
本發明化合物(53)

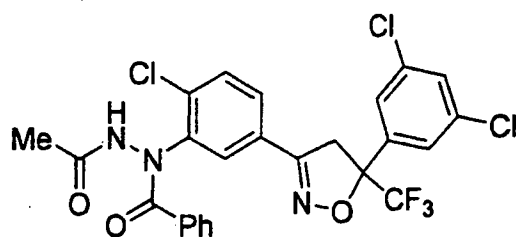


熔點:117°C

製備例 54

於室溫，對 200mg 之後文所述參考製備例 35 所獲得化合物與 58mg 之三乙胺於 2mL 四氫呋喃之溶液，滴加 38mg 之乙醯氯，接著於相同溫度攪拌 1 小時。對反應混合物添加乙酸乙酯。有機層以水清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 156mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(54))。

本發明化合物(54)



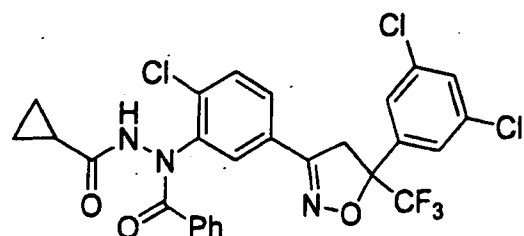
熔點:172°C

製備例 55

於室溫，對 200mg 之後文所述參考製備例 35 所獲得化合物與 51mg 之三乙胺於 2mL 四氫呋喃之溶液，滴加 54mg 之環丙烷甲醯氯，接著於相同溫度攪拌 1 小時。對反應混

合物添加乙酸乙酯。有機層以水清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 103mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(55))。

本發明化合物(55)



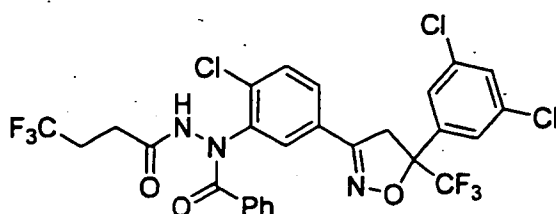
●● 熔點:157°C

製備例 56

於室溫，對 200mg 之後文所述參考製備例 35 所獲得化合物與 65mg 之三乙胺於 2mL 四氫呋喃之溶液，滴加 78mg 之 4,4,4-三氟丁醯氯，接著於相同溫度攪拌 1 小時。對反應混合物添加乙酸乙酯。有機層以水清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 211mg

●● 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(56))。

本發明化合物 (56)



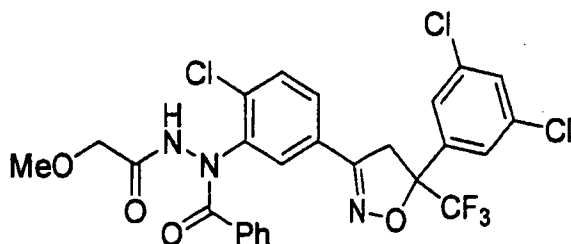
●● 熔點:104°C

製備例 57

於室溫，對 300mg 之後文所述參考製備例 35 所獲得化合物與 85mg 之三乙胺於 2mL 四氫呋喃之溶液，滴加 79mg

之甲氧基乙醯氯，接著於相同溫度攪拌 1 小時。對反應混合物添加乙酸乙酯。有機層以水清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 297mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(57))。

本發明化合物(57)

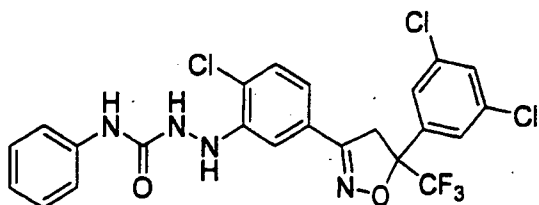


熔點: 92°C

製備例 58

於室溫，對 241mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物於 2mL 四氫呋喃之溶液，滴加 82mg 之異氰酸苯酯，接著於相同溫度攪拌 3 小時。反應混合物減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 187mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(58))。

本發明化合物(58)



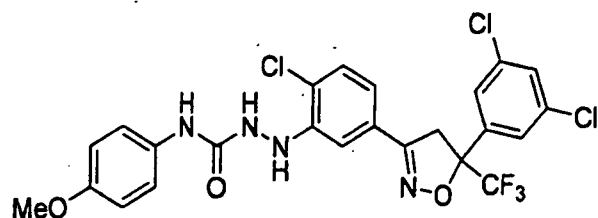
熔點: 131°C

製備例 59

於室溫，對 200mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物於 6mL 四氫呋喃之溶液，滴加 85mg 之異氰酸

4-甲氧基苯酯，接著於相同溫度攪拌 3 小時。反應混合物減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 191mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(59))。

本發明化合物(59)

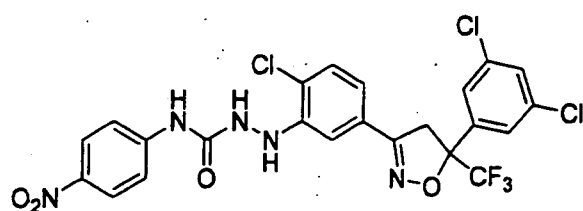


熔點: 131°C

製備例 60

於室溫，對 196mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物於 5mL 四氫呋喃之溶液，滴加 136mg 之異氰酸 4-硝基苯基酯，接著於相同溫度攪拌 3 小時。反應混合物減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 110mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(60))。

本發明化合物(60)



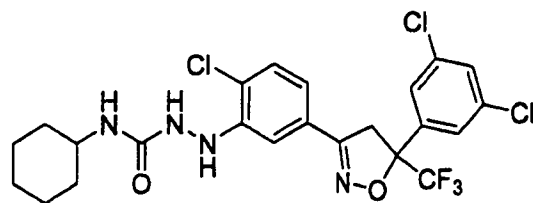
熔點: 201°C

製備例 61

於室溫，對 220mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物於 6mL 四氫呋喃之溶液，滴加 79mg 之異氰酸環己酯，接著於相同溫度攪拌 3 小時。反應混合物減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 100mg 之下式所表示之化

合物(後文中稱為本發明化合物(61))。

本發明化合物(61)

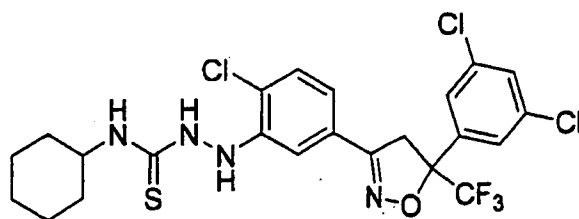


熔點:101°C

製備例 62

於室溫，對 340mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物於 6mL 四氫呋喃之溶液，滴加 173mg 之異硫氰酸環己酯，接著於相同溫度攪拌 3 小時。反應混合物減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 135mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(62))。

本發明化合物(62)

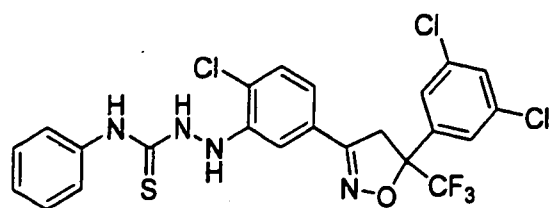


熔點:126°C

製備例 63

於室溫，對 240mg 之後文所述參考製備例 21 所獲得粗製化合物與 in 6mL 四氫呋喃之溶液，滴加 114mg 之異硫氰酸苯基酯，接著於相同溫度攪拌 3 小時。反應混合物減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 200mg 之下式所表示之化合物(後文中稱為本發明化合物(63))。

本發明化合物(63)

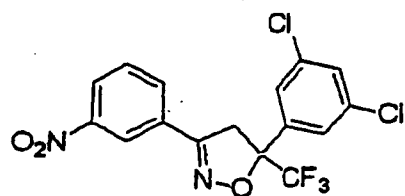


熔點: 213°C

接著，用於製造本發明化合物之中間體的製造係顯示為參考製備例。

參考製備例 1

於室溫，對 249mg 之 3-硝基苯甲醛肟於 15ml 之 N,N-二甲基甲醯胺之溶液，添加 201mg 之 N-氯琥珀醯亞胺，接著於 60°C 攪拌 1 小時。反應溶液冷卻至室溫，且對其添加 362mg 之 2-(3,5-二氯苯基)-3,3,3-三氟-1-丙烯後添加 152mg 之三乙胺，接著於室溫攪拌 6 小時。對反應混合物添加水，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 232mg 之下式所表示之化合物。

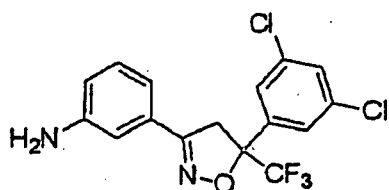


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.43 (1H, br s), 8.34-8.32 (1H, m), 8.10 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 7.67-7.65 (1H, m), 7.52 (2H, s), 7.45-7.45 (1H, m), 4.14 (1H, d, $J = 17.3$ Hz), 3.76 (1H, d, $J = 17.3$ Hz).

參考製備例 2

對 1mL 之 2.5% 乙酸水溶液添加 192mg 之鐵粉(10 至 20

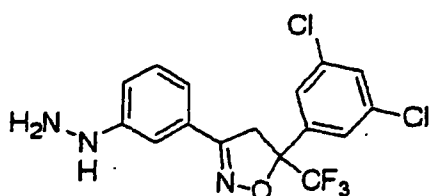
網眼)。於 75°C，對其添加 232mg 之參考製備例所製備之化合物於 1.5mL 乙醇的懸浮物，接著於相同溫度攪拌 15 分鐘。再對其添加 300mg 之鐵粉，接著於室溫攪拌 1 小時。反應混合物冷卻至室溫，過濾後，以乙酸乙酯清洗。濾液藉由添加水與乙酸乙酯而萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 198mg 之下式所表示之化合物。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.51 (2H, br s), 7.42 (1H, t, $J = 1.9$ Hz), 7.20 (1H, t, $J = 7.8$ Hz), 7.04 (1H, t, $J = 1.9$ Hz), 6.95-6.93 (1H, m), 6.77-6.75 (1H, m), 4.05 (1H, d, $J = 17.1$ Hz), 3.77 (2H, br s), 3.66 (1H, d, $J = 17.1$ Hz).

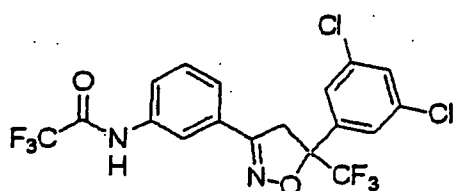
參考製備例 3

於室溫，對 1.0g 之之參考製備例 2 所製備化合物於 4mL 之 1,4-二噁烷之溶液，添加 7mL 濃鹽酸。於相同溫度攪拌 20 分鐘後，溶液冷卻至 0°C 且對其滴加 184mg 之亞硝酸鈉於 4mL 水之溶液。於相同溫度攪拌 15 分鐘後，對反應溶液滴加 1.11g 之氯化錫(II)於 2mL 濃鹽酸之溶液。反應混合物藉由添加 2N 氫氧化鈉中和後，水層以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 1.0 g 之下式所表示之粗製化合物。



參考製備例 4

於 0°C，對 3.0g 之參考製備例 2 所製備化合物與 971mg 之三乙胺於 20mL 四氫呋喃之溶液，滴加 1.85g 之三氟乙酸酐。於相同溫度攪拌 15 分鐘後，對其添加飽和碳酸氫鈉水溶液，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 3.84g 之下式所表示之化合物。

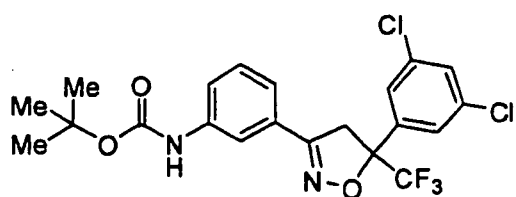


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.02 (1H, br s), 7.94 (1H, t, $J = 1.8$ Hz), 7.66-7.64 (1H, m), 7.57-7.55 (1H, m), 7.49-7.43 (4H, m), 4.09 (1H, d, $J = 17.3$ Hz), 3.71 (1H, d, $J = 17.3$ Hz).

參考製備例 5

於室溫，對 3.84g 之參考製備例 4 所製備化合物與 8.21g 之二羧酸二第三丁酯於 20mL 四氫呋喃之溶液，添加 195mg 之 4-二甲基吡啶，接著於相同溫度攪拌 1.5 小時。對反應混合物添加乙酸乙酯。有機層以 2N 鹽酸清洗後以飽和碳酸氫鈉水溶液清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物溶於 20mL 甲醇。於室溫，對溶液添加 10mL 水與 2.76g 之碳酸鈉，接著於相同溫度攪拌 2 小時。將水添加至混合物，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫

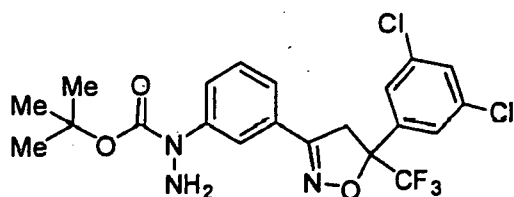
水後減壓濃縮而獲得 3.5g 之下式所表示之化合物。



¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.81 (1H, s), 7.51 (2H, s), 7.42-7.39 (2H, m), 7.35-7.31 (2H, m), 6.55 (1H, br s), 4.11 (1H, d, J = 16.9 Hz), 3.70 (1H, d, J = 16.9 Hz), 1.53 (9H, s).

參考製備例 6

對 3.50g 之參考製備例 5 所製備化合物於 22mL 第三丁基甲基醚之溶液，添加 23mL 之 28%氫氧化鈉水溶液、7mL 氨水、2.56g 之氯化銨與 100mg 之三辛基甲基銨氯化物。於室溫，歷時 20 分中對混合物滴加 53mL 之 5%次氯酸鈉水溶液。於相同溫度攪拌 12 小時後，分離有機層且水層再次以第三丁基甲基醚萃取。合併有機層，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 1.52g 之下式所表示之化合物。

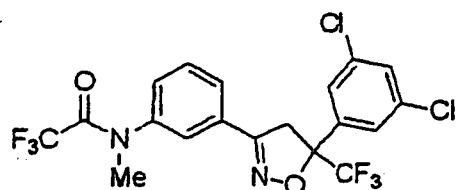


¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.87 (1H, s), 7.72-7.29 (6H, m), 4.42 (2H, br s), 4.09 (1H, d, J = 17.2 Hz), 3.69 (1H, d, J = 17.2 Hz), 1.53 (9H, s).

參考製備例 7

於室溫，對 3.71g 之參考製備例 4 所製備化合物與

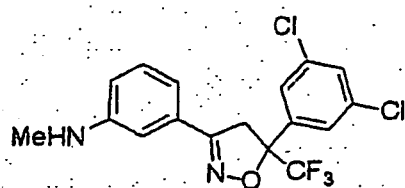
1. 34g 之碘甲烷於 20mL 之 N,N-二甲基甲醯胺之溶液，添加 1.31g 之碳酸鈉。於相同溫度攪拌混合物 12 小時。對反應混合物添加乙酸乙酯，接著以 2N 鹽酸清洗後以飽和碳酸氫鈉水溶液清洗。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 3.70g 之下式所表示之化合物。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.69-7.35 (7H, m), 4.09 (1H, d, $J = 17.3$ Hz), 3.71 (1H, d, $J = 17.3$ Hz), 3.46-3.43 (3H, m).

參考製備例 8

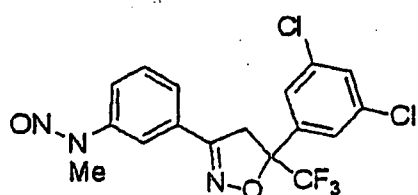
於室溫，對 3.52g 之參考製備例 7 所製備化合物於 15mL 甲醇之溶液，添加 2.00g 之碳酸鈉與 5mL 水。於相同溫度攪拌 2 小時後，對其添加乙酸乙酯且水層以乙酸乙酯萃取。有機層以 2% 鹽酸清洗後以飽和碳酸氫鈉水溶液清洗。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 2.80g 之下式所表示之化合物。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.51 (2H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.41 (1H, t, $J = 1.8$ Hz), 7.21 (1H, t, $J = 7.9$ Hz), 6.95 (1H, t, $J = 2.0$ Hz), 6.87 (1H, ddd, $J = 7.6, 1.5, 1.0$ Hz), 6.69 (1H, ddd, $J = 8.3, 2.4, 0.7$ Hz), 4.07 (1H, d, $J = 17.3$ Hz), 3.85 (1H, br s), 3.67 (1H, d, $J = 17.3$ Hz), 2.86 (3H, s).

參考製備例 9

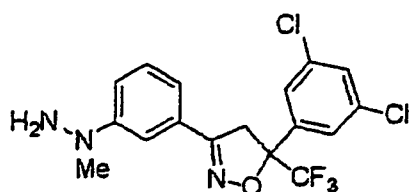
於室溫，對 2.6g 之參考製備例 8 所製備化合物於 4mL 四氫呋喃之溶液，添加 1.5mL 濃鹽酸與 3.0mL 水。於室溫攪拌 15 分鐘後，於 0°C，對混合物滴加 581mg 之亞硝酸鈉於 5mL 水之溶液。於相同溫度攪拌 1 小時後，對其添加飽和碳酸氫鈉水溶液且水層以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 2.78g 之下式所表示之化合物。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.89-7.88 (1H, m), 7.67-7.64 (2H, m), 7.56-7.53 (3H, m), 7.43-7.43 (1H, m), 4.14 (1H, d, $J = 17.4$ Hz), 3.76 (1H, d, $J = 17.4$ Hz), 3.47 (3H, s).

參考製備例 10

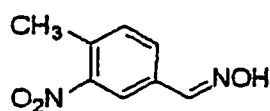
於室溫，對 1.00g 之參考製備例 9 所製備化合物、2mL 乙醇、2mL 水與 2mL 乙酸之混合物，添加 695mg 之鋅。於室溫攪拌 5 小時後，過濾混合物。對濾液添加無水碳酸氫鈉接著以氯仿萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 1.1g 之下式所表示之粗製化合物。



參考製備例 11

於室溫，對 3.00g 之 4-甲基-3-硝基苯甲醛、1.64g 之羥胺鹽酸鹽、30mL 乙醇與 15mL 水之混合物，添加 2.24g 之乙酸鈉，接著於室溫攪拌 1 小時。反應混合物添加至水，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 2.77g 之 5-羥基亞胺基甲基-2-甲基硝基苯。

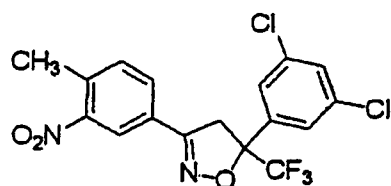
5-羥基亞胺基甲基-2-甲基硝基苯



$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- d_6) δ : 11.53 (1H, s), 8.24 (1H, s), 8.17 (1H, d, $J = 1.7$ Hz), 7.84 (1H, dd, $J = 8.0, 1.7$ Hz), 7.54 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 2.52 (3H, s).

參考製備例 12

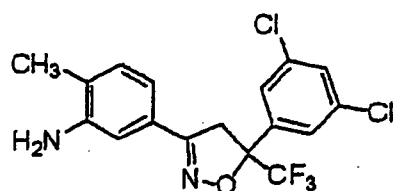
將 2.77g 之參考製備例 11 所獲得之 5-羥基亞胺基甲基-2-甲基硝基苯與 2.06g 之 N-氯琥珀醯亞胺於 30mL 之 N,N-二甲基甲醯胺之溶液於 50°C 攪拌 1 小時。反應溶液冷卻至室溫，且對其添加 3.71g 之 2-(3,5-二氯苯基)-3,3,3-三氟-1-丙烯與 1.56g 之三乙胺。混合物於室溫攪拌 6 小時。對反應混合物添加水，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 4.99g 之下式所表示之化合物。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.16 (1H, d, $J = 1.9$ Hz), 7.90 (1H, dd, $J = 8.1, 1.9$ Hz), 7.51 (2H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.45-7.43 (2H, m), 4.11 (1H, d, $J = 17.1$ Hz), 3.73 (1H, d, $J = 17.1$ Hz), 2.66 (3H, s).

參考製備例 13

對 19mL 之 2.5% 乙酸水溶液添加 1.89g 之鐵粉(10 至 20 網眼)。於 75°C ，對其添加 4.62g 之參考製備例 12 所製備化合物於 29mL 乙醇之懸浮物，接著於相同溫度攪拌 15 分鐘。於相同溫再對其添加 1.80g 之鐵粉，接著於相同溫度攪拌 1 小時。將反應混合物冷卻至室溫，過濾後以乙酸乙酯清洗。濾液藉由添加飽和碳酸氫鈉水溶液與乙酸乙酯而萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 3.18g 之下式所表示之化合物。

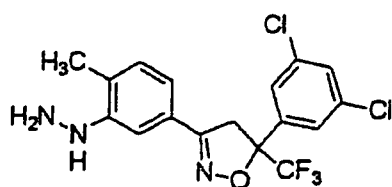


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.51 (2H, d, $J = 1.4$ Hz), 7.41 (1H, t, $J = 1.8$ Hz), 7.08 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.05 (1H, d, $J = 1.8$ Hz), 6.88 (1H, dd, $J = 7.8, 1.7$ Hz), 4.04 (1H, d, $J = 17.1$ Hz), 3.71 (2H, br s), 3.65 (1H, d, $J = 17.1$ Hz), 2.19 (3H, s).

參考製備例 14

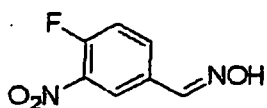
於室溫，對 420mg 之參考製備例 13 所製備化合物，

添加 2mL 濃鹽酸。於相同溫度攪拌 20 分鐘後，溶液冷卻至 0°C 且對其滴加 82mg 之亞硝酸鈉於 0.5mL 水之溶液。於相同溫度攪拌 10 分鐘後，對反應溶液滴加 451mg 之氯化錫(II)於 0.5mL 濃鹽酸之溶液。反應混合物藉由添加飽和碳酸氫鈉水溶液中中和。水層以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 420mg 之下式所表示之粗製化合物。



參考製備例 15

對 20mL 乙醇與 10mL 水之混合物，添加 2g 之 4-氟-3-硝基苯甲醛、1.07g 之羥胺鹽酸鹽與 1.45g 之乙酸鈉。混合物於室溫攪拌 6 小時。對反應混合物添加水，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 1.95g 之下式所表示之化合物。

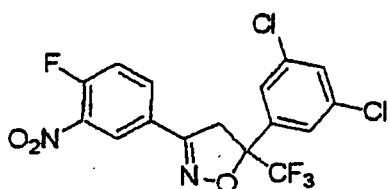


$^1\text{H-NMR}$ (DMSO- D_6) δ : 11.63 (1H, s), 8.34 (1H, dd, $J = 7.2, 2.2$ Hz), 8.28 (1H, s), 8.04-8.02 (1H, m), 7.65-7.62 (1H, m).

參考製備例 16

1.95 之參考製備例所獲得化合物與 1.42g 之 N-氯琥珀醯亞胺於 20mL 二甲基甲醯基之溶液，於 60°C 攪拌 1 小時。將反應混合溶液冷卻至室溫，且對其添加 2.55g 之

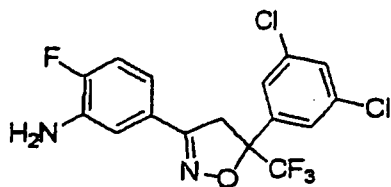
2-(3,5-二氯苯基)-3,3,3-三氟-1-丙烯後添加 1.07 g 之三乙胺，接著於相同溫度攪拌 6 小時。對反應混合物添加水，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。所得殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 1.40g 之下式所表示之化合物。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.26 (1H, dd, $J = 6.9, 2.3$ Hz), 8.08-8.05 (1H, m), 7.51 (2H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.45 (1H, t, $J = 1.9$ Hz), 7.41 (1H, dd, $J = 10.1, 8.7$ Hz), 4.11 (1H, d, $J = 17.4$ Hz), 3.73 (1H, d, $J = 17.9$ Hz).

參考製備例 17

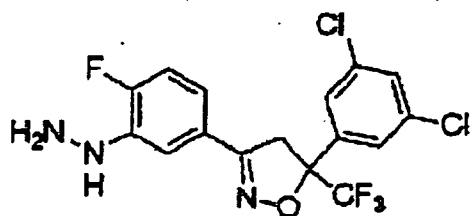
於室溫，對 0.2g 之乙酸於 7mL 水之溶液，添加 1.85g 之鐵粉。於 75°C ，對混合物添加 1.40g 之參考製備例 16 所獲得化合物於 15mL 乙醇之懸浮物，接著於 75°C 攪拌 20 分鐘。過濾反應混合物且減壓濃縮濾液。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 806mg 之下式所表示之化合物。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.50 (2H, d, $J = 1.4$ Hz), 7.42 (1H, t, $J = 1.8$ Hz), 7.18 (1H, dd, $J = 8.5, 2.2$ Hz), 7.01 (1H, dd, $J = 10.6, 8.5$ Hz), 6.90-6.87 (1H, m), 4.03 (1H, d, $J = 17.0$ Hz), 3.85 (2H, br s), 3.64 (1H, d, $J = 17.0$ Hz).

參考製備例 18

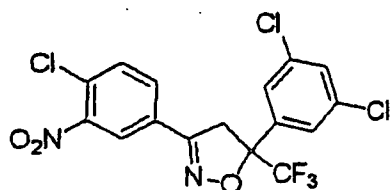
於室溫，對 500mg 之參考製備例 17 所製備化合物於 2mL 之 1,4-二噁烷之溶液，添加 4mL 濃鹽酸。於相同溫度攪拌後 20 分鐘，溶液冷卻至 0°C 且對其滴加 96mg 之亞硝酸鈉於 5mL 水之溶液。於相同溫度攪拌後 15 分鐘，對反應溶液滴加 528mg 之氯化錫(II)於 1mL 濃鹽酸之溶液。反應混合物藉由添加 2N 氫氧化鈉而中和。水層以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 412mg 之下式所表示之粗製化合物。



參考製備例 19

將 2.92g 之 2-氯-5-羥基亞胺基甲基硝基苯與 1.94g 之 N-氯琥珀醯亞胺於 30mL 二甲基甲醯胺之溶液，於 60°C 攪拌 1 小時。溶液冷卻至室溫後，對其添加 3.50g 之 2-(3,5-

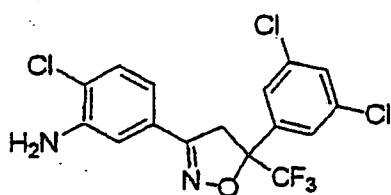
二氯苯基)-3,3,3-三氟-1-丙烯後添加 1.46g 之三乙胺，接著攪拌 6 小時。對反應混合物添加水，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 4.42g 之下式所表示之化合物。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.09 (1H, d, $J = 2.1$ Hz), 7.89 (1H, dd, $J = 8.5, 2.1$ Hz), 7.65 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.50 (2H, d, $J = 1.6$ Hz), 7.45 (1H, t, $J = 1.6$ Hz), 4.09 (1H, d, $J = 17.3$ Hz), 3.71 (1H, d, $J = 17.3$ Hz).

參考製備例 20

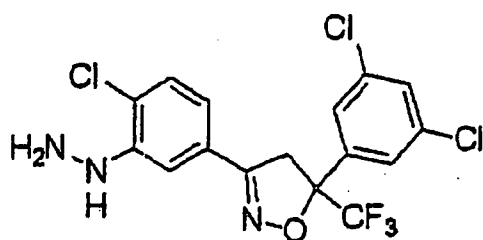
於室溫，對 0.38g 之乙酸、15mL 水與 30mL 乙醇之混合物添加 3.46g 之鐵粉，且於 75°C 對其添加 2.73g 之參考製備例 19 所獲得化合物，接著於 75°C 攪拌 50 分鐘。過濾反應混合物且減壓濃縮濾液。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 1.65g 之下式所表示之化合物。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.49 (2H, d, $J = 1.7$ Hz), 7.42 (1H, t, $J = 1.7$ Hz), 7.29 (1H, d, $J = 8.4$ Hz), 7.13 (1H, d, $J = 2.0$ Hz), 6.89 (1H, dd, $J = 8.4, 2.0$ Hz), 4.18 (2H, br s), 4.03 (1H, d, $J = 17.1$ Hz), 3.64 (1H, d, $J = 16.4$ Hz).

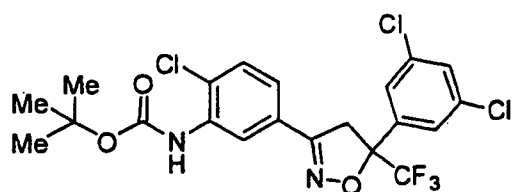
參考製備例 21

於室溫，對 500mg 之參考製備例 20 所製備化合物於 2mL 之 1,4-二噁烷之溶液，添加 6mL 濃鹽酸。於相同溫度攪拌 20 分鐘後，溶液冷卻至 0°C 且對其滴加 93mg 之亞硝酸鈉於 3mL 水之溶液。於相同溫度攪拌 15 分鐘後，對反應溶液滴加之 507mg 之氯化錫(II)於 4mL 濃鹽酸之溶液。反應混合物藉由添加中和 2N 氫氧化鈉而中和。水層以第三丁基甲基醚萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 510mg 之下式所表示之粗製化合物。



參考製備例 22

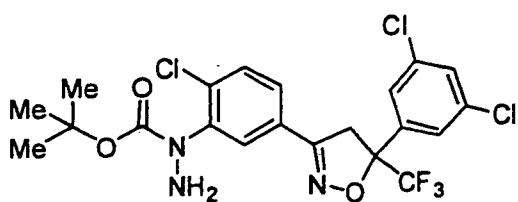
對 6.3g 之三光氣於 50mL 甲苯之溶液，滴加 8.7g 之參考製備例 20 所獲得化合物於 50mL 甲苯與 10mL 四氫呋喃之溶液。再添加 50mL 甲苯至反應溶液，接著於 80°C 攪拌 1 小時。反應混合物冷卻至室溫後減壓濃縮，且對其添加 100mL 第三丁醇。於室溫，對該溶液添加 14.6g 之三乙胺，接著於相同溫度攪拌 16 小時。對反應混合物添加飽和碳酸氫鈉水溶液，接著以氯仿萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 9.81g 之下式所表示之化合物。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.39 (1H, d, $J = 2.1$ Hz), 7.52 (2H, d, $J = 1.8$ Hz), 7.47 (1H, dd, $J = 8.5, 2.1$ Hz), 7.42 (1H, t, $J = 1.8$ Hz), 7.39 (1H, d, $J = 8.5$ Hz), 7.09 (1H, br s), 4.11 (1H, d, $J = 17.3$ Hz), 3.70 (1H, d, $J = 17.3$ Hz), 1.55 (9H, s).

參考製備例 23

於室溫，對 760mg 之氫化鈉(60%油中)於 200mL 四氫呋喃之懸浮物，滴加 8.80g 之參考製備例 22 所製備化合物於 50mL 四氫呋喃之溶液。混合物於相同溫度攪拌 20 分鐘後，於室溫對其添加 6.0g 之 O-(二苯基磷醯基)羥基胺。混合物於相同溫度攪拌 15 小時後，對其添加水與乙酸乙酯且水層以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 6.58g 之下式所表示之化合物。

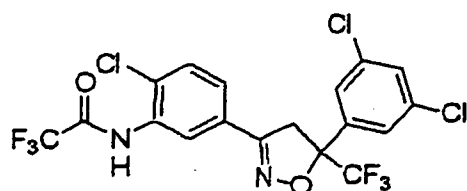


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.55-7.44 (6H, m), 4.07 (1H, d, $J = 17.1$ Hz), 3.68 (1H, d, $J = 17.1$ Hz), 1.41 (9H, br s).

參考製備例 24

於 0°C ，對 3.04g 之參考製備例 20 所獲得化合物與 772mg 之三乙胺於 20mL 四氫呋喃之溶液，滴加 1.47g 之三氟乙酸酐。於相同溫度攪拌 30 分鐘後，反應混合物以第三

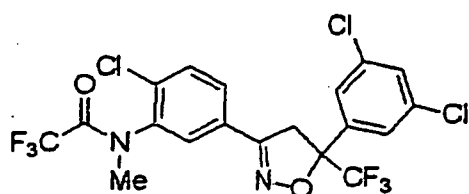
丁基甲基醚稀釋。對反應混合物添加乙酸乙酯。有機層以 2N 鹽酸清洗後以飽和碳酸氫鈉水溶液清洗，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 3.63g 之下式所表示之化合物。



¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.53 (1H, d, J = 2.2 Hz), 8.48 (1H, br s), 7.67 (1H, dd, J = 8.5, 2.0 Hz), 7.52 (1H, d, J = 8.5 Hz), 7.50 (2H, s), 7.43-7.42 (1H, m), 4.09 (1H, d, J = 17.3 Hz), 3.71 (1H, d, J = 17.3 Hz).

參考製備例 25

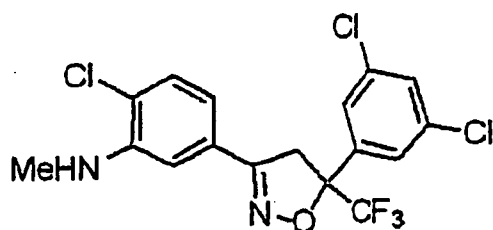
於室溫，對氫化鈉(60%油中)於 15mL 之 N,N-二甲基甲醯胺之懸浮物，滴加 3.6g 之參考製備例 24 所獲得化合物於 15mL 之 N,N-二甲基甲醯胺之溶液。混合物於相同溫度攪拌 20 分鐘後，對其添加 1.52g 之碘甲烷，接著攪拌 1 小時。對反應混合物添加 2N 鹽酸，接著以第三丁基甲基醚萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 3.73 g 之下式所表示之化合物。



¹H-NMR (CDCl₃) δ: 7.70-7.40 (6H, m), 4.06 (1H, dd, J = 17.2, 13.0 Hz), 3.73-3.64 (1H, m), 3.33-3.32 (3H, m).

參考製備例 26

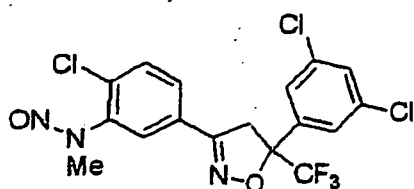
於室溫，對 3.6g 之參考製備例 25 所獲得化合物於 20mL 甲醇之溶液添加 1.97g 之碳酸鉀，接著於相同溫度攪拌 3 小時。過濾沉澱。對濾液添加水，接著以第三丁基甲基醚萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 2.20g 之下式所表示之化合物。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.51 (2H, d, $J = 1.8$ Hz), 7.42 (1H, t, $J = 1.8$ Hz), 7.28 (1H, d, $J = 8.0$ Hz), 6.99 (1H, d, $J = 2.0$ Hz), 6.78 (1H, dd, $J = 8.0, 2.0$ Hz), 4.48 (1H, d, $J = 5.1$ Hz), 4.07 (1H, d, $J = 17.2$ Hz), 3.67 (1H, d, $J = 17.2$ Hz), 2.94 (3H, d, $J = 5.1$ Hz).

參考製備例 27

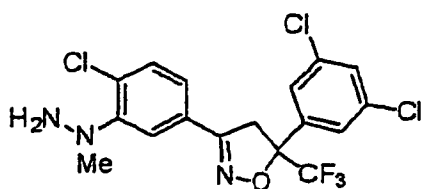
對 2.55g 之參考製備例 26 所製備化合物於 4mL 四氫呋喃之溶液，添加 4.5mL 濃鹽酸後添加 5.0mL 水。於室溫攪拌 10 分鐘後，混合物冷卻至 0°C 且對其滴加 539mg 之亞硝酸鈉於 5mL 水之溶液。混合物於相同溫度攪拌 1 小時後，藉由添加飽和碳酸氫鈉水溶液中和後以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 2.69g 之下式所表示之化合物。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.84-7.31 (6H, m), 4.09 (1H, d, $J = 17.3$ Hz), 3.71 (1H, d, $J = 17.3$ Hz), 3.41 (3H, s).

參考製備例 28

於室溫，對 2.61g 之參考製備例 27 所製備化合物於 4mL 四氫呋喃之溶液，添加 8mL 乙醇、8mL 水與 8mL 乙酸。之後於室溫，對混合物添加 695mg 之鋅。混合物攪拌於室溫攪拌 3 小時後過濾。對濾液添加無水碳酸氫鈉接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 764mg 之下式所表示之化合物。

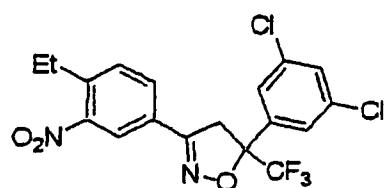


$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.68-7.67 (1H, m), 7.51 (2H, s), 7.42-7.40 (2H, m), 7.23-7.20 (1H, m), 4.08 (1H, d, $J = 17.2$ Hz), 3.85 (2H, br s), 3.69 (1H, d, $J = 17.2$ Hz), 3.06 (3H, s).

參考製備例 29

將 4.30g 之 2-乙基-5-羥基亞胺基甲基硝基苯與 2.97g 之 N-氯琥珀醯亞胺於 40mL 二甲基甲醯胺之溶液，於 60°C 攪拌 1 小時。將反應溶液冷卻至室溫。對其添加 3.5g 之 2-(3,5-二氯苯基)-3,3,3-三氟-1-丙烯後添加 1.7g 之

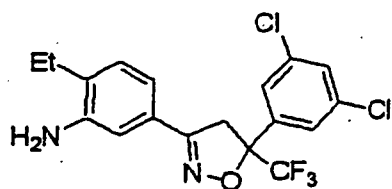
三乙胺，接著攪拌 6 小時。對反應混合物添加水，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 5.74g 之下式所表示之化合物。



¹H-NMR (CDCl₃) δ: 8.07 (1H, d, J = 1.9 Hz), 7.91 (1H, dd, J = 8.0, 1.9 Hz), 7.51 (2H, d, J = 1.6 Hz), 7.46 (1H, d, J = 8.0 Hz), 7.44 (1H, t, J = 1.6 Hz), 4.10 (1H, d, J = 17.3 Hz), 3.72 (1H, d, J = 17.3 Hz), 2.96 (2H, q, J = 7.5 Hz), 1.30 (3H, t, J = 7.5 Hz).

參考製備例 30

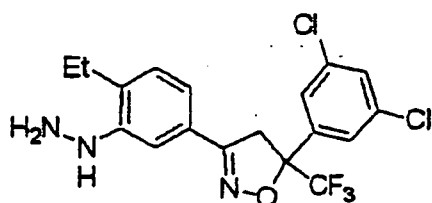
於室溫，對 0.5mL 乙酸、22mL 水與 34mL 乙醇之混合物，添加 4.33g 之鐵粉。於 75°C，對混合物添加 5.60g 之參考製備例 29 所獲得化合物，接著於相同溫度攪拌 3 小時。反應混合物冷卻至室溫，過濾後以乙酸乙酯清洗。對濾液添加飽和碳酸氫鈉水溶液，接著以乙酸乙酯萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 5.20g 之下式所表示之化合物。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.51 (2H, d, $J = 1.7$ Hz), 7.41 (1H, t, $J = 1.7$ Hz), 7.10 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.04 (1H, d, $J = 1.7$ Hz), 6.93 (1H, dd, $J = 7.8, 1.7$ Hz), 4.05 (1H, d, $J = 17.1$ Hz), 3.74 (2H, br s), 3.65 (1H, d, $J = 17.1$ Hz), 2.52 (2H, q, $J = 7.5$ Hz), 1.25 (3H, t, $J = 7.5$ Hz).

參考製備例 31

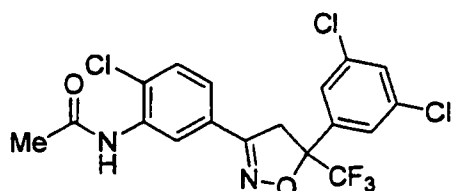
於室溫，對 1.00g 之參考製備例 30 所製備化合物於 2mL 之 1,4-二噁烷之溶液，添加 4 mL 濃鹽酸。混合物於相同溫度攪拌 20 分鐘後冷卻至 0°C 。對溶液滴加 188mg 之亞硝酸鈉於 1mL 水之溶液。於相同溫度攪拌 15 分鐘後，對反應溶液滴加 1.03g 之氯化錫(II)於 2mL 濃鹽酸之溶液。反應混合物藉由添加 2N 氫氧化鈉中和。水層以氯仿萃取。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 1.31 g 之下式所表示之粗製化合物。



參考製備例 32

將 2.0 g 之參考製備例 20 所製備化合物於 10mL 乙酸酐之溶液，於室溫攪拌 0.5 小時。反應混合物減壓濃縮。濃縮物溶於乙酸乙酯後，以飽和碳酸氫鈉水溶液清洗後以

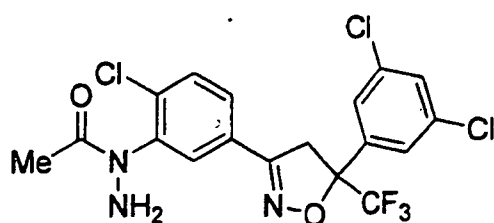
飽和氯化鈉水溶液清洗。有機層於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 3.0g 之下式所表示之粗製化合物。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 8.59 (1H, br s), 7.67 (1H, br s), 7.57 (1H, dd, $J = 8.4, 2.1$ Hz), 7.50 (2H, d, $J = 1.2$ Hz), 7.43-7.42 (2H, m), 4.09 (1H, d, $J = 17.4$ Hz), 3.70 (1H, d, $J = 17.4$ Hz), 2.28 (3H, s).

參考製備例 33

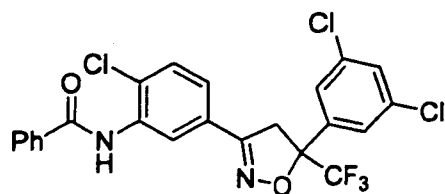
對 2.2g 之參考製備例 32 所製備化合物於 30mL 第三丁基甲基醚之溶液，添加 14mL 之 28% 氫氧化鈉水溶液、4.5mL 氨水、1.56g 之氯化銨與 274mg 之三辛基甲基銨氯化物。於室溫，歷時 20 分鐘對混合物滴加 32mL 之 5% 次氯酸鈉水溶液。於相同溫度攪拌 2 小時後，分離有機層且水層再以第三丁基甲基醚萃取。合併有機層，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 2.0g 之下式所表示之化合物。



熔點: 92°C

參考製備例 34

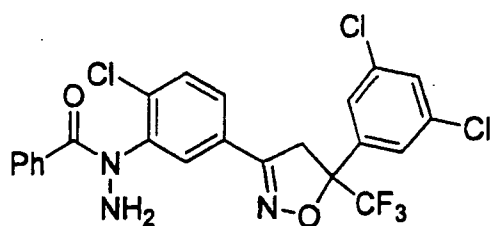
於室溫，對 2.0g 之參考製備例 20 所製備化合物於 5mL 吡啶之溶液，添加 1.4g 之苯甲醯氯。於相同溫度攪拌 0.5 小時後，對反應混合物添加乙酸乙酯，接著以 3% 鹽酸清洗。合併有機層，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮而獲得 2.4g 之下式所表示之粗製化合物。



$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3) δ : 7.69-7.44 (1H, m), 7.68 (1H, dd, $J = 4.1, 2.0$ Hz), 7.63 (1H, dd, $J = 5.7, 2.1$ Hz), 7.58 (1H, d, $J = 7.8$ Hz), 7.49 (2H, d, $J = 7.6$ Hz), 7.44 (1H, t, $J = 2.0$ Hz), 4.74 (2H, s), 4.37 (OH, s), 4.07 (1H, dd, $J = 17.2, 6.7$ Hz), 2.42 (1H, s), 1.92 (2H, d, $J = 2.9$ Hz).

參考製備例 35

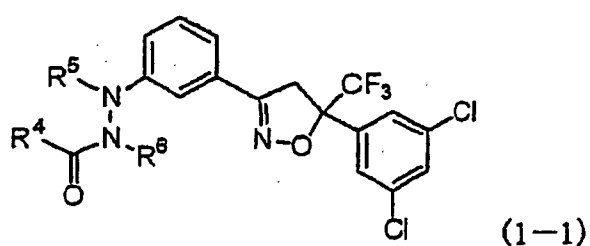
對 2.4g 之參考製備例 34 所製備化合物於 20mL 四氫呋喃之溶液，添加 14mL 之 8% 氫氧化鈉水溶液、4.5mL 氨水、2.56g 之氯化銨與 274mg 之三辛基甲基銨氯化物。於室溫，歷時 1 小時對混合物滴加 48mL 之 5% 次氯酸鈉水溶液。於相同溫度攪拌 2 小時後，分離有機層且水層再以第三丁基甲基醚萃取。合併有機層，於無水硫酸鈉脫水後減壓濃縮。殘餘物進行矽膠管柱層析而獲得 1.8g 之下式所表示之化合物。



熔點：87℃

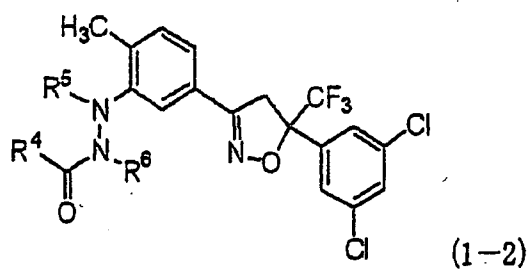
本發明化合物之具體實例係如下所示。

式(1-1)所表示之化合物：



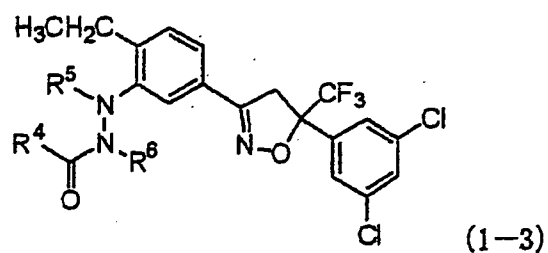
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-2)所表示之化合物：



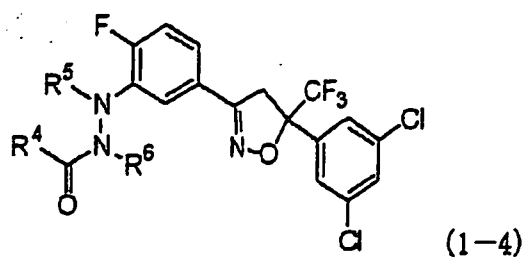
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-3)所表示之化合物：



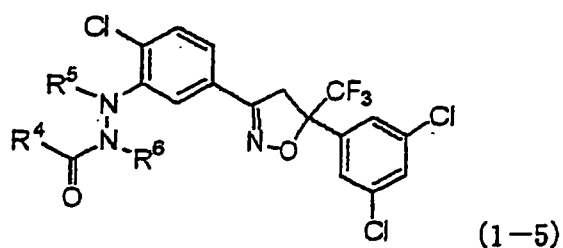
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-4)所表示之化合物：



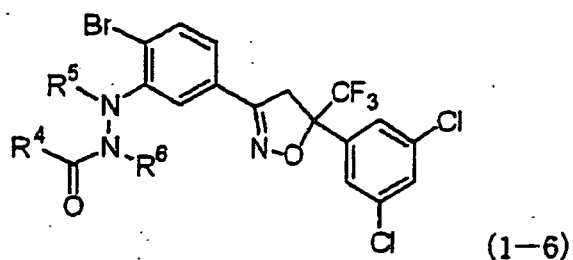
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-5)所表示之化合物：



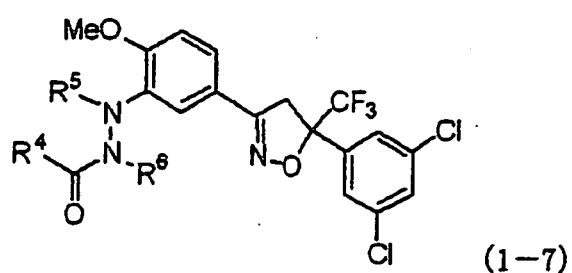
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-6)所表示之化合物：



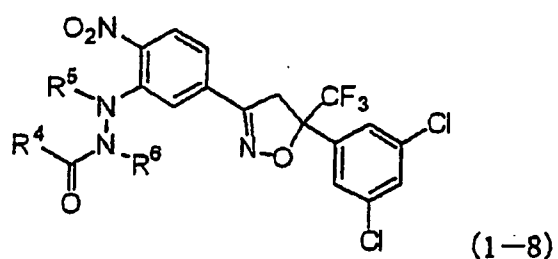
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-7)所表示之化合物：



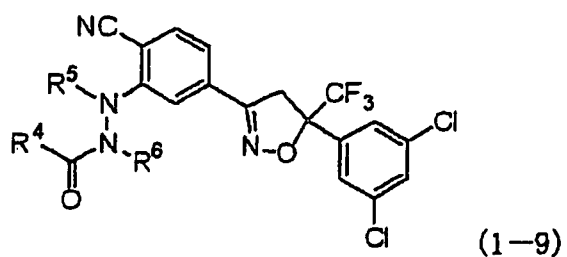
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-8)所表示之化合物：



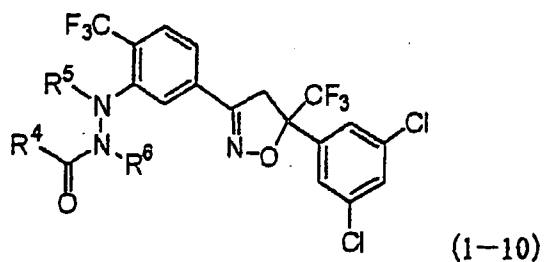
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-9)所表示之化合物：



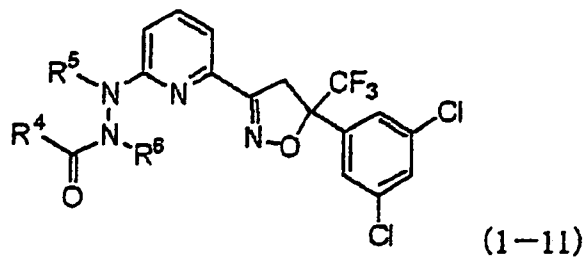
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-10)所表示之化合物：



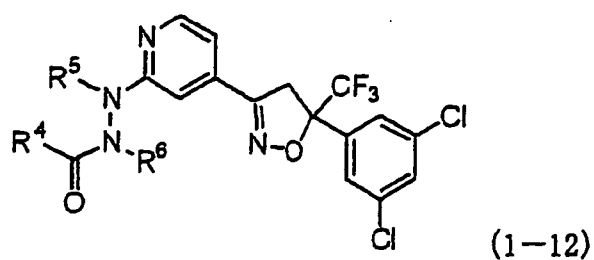
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-11)所表示之化合物：



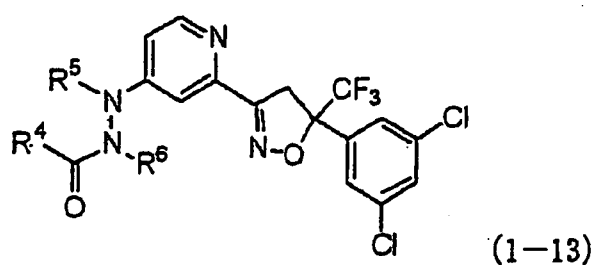
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-12)所表示之化合物：



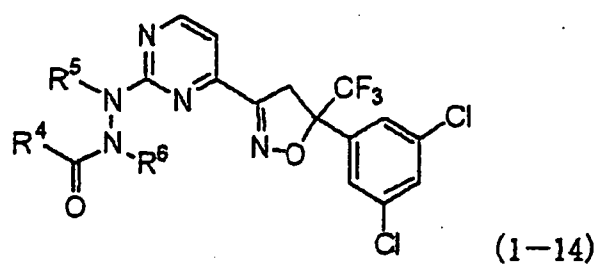
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-13)所表示之化合物：



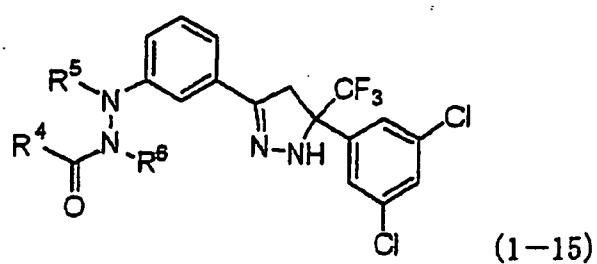
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-14)所表示之化合物：



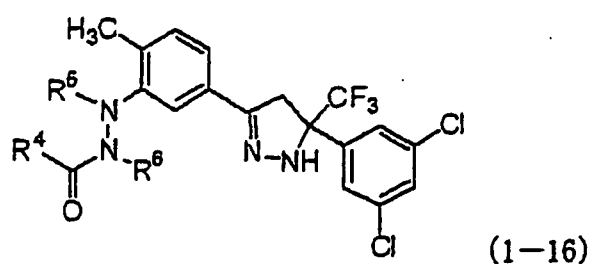
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-15)所表示之化合物：



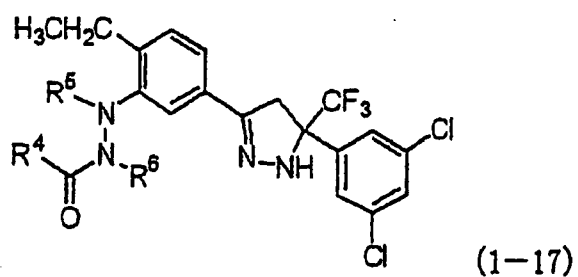
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-16)所表示之化合物：



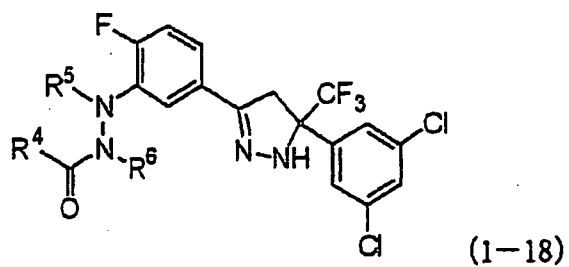
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-17)所表示之化合物：



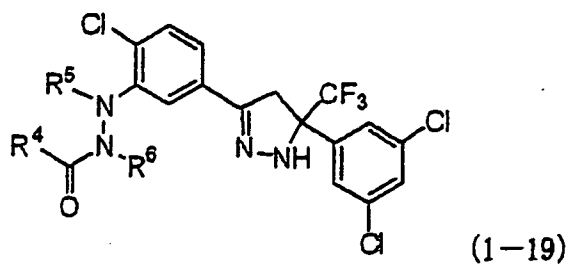
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-18)所表示之化合物：



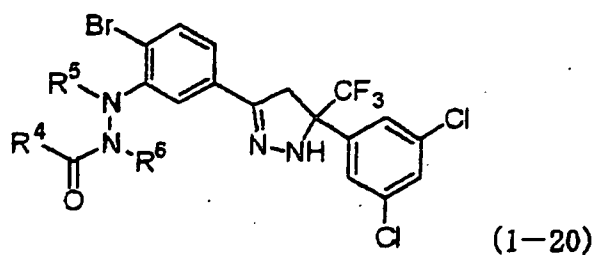
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-19)所表示之化合物：



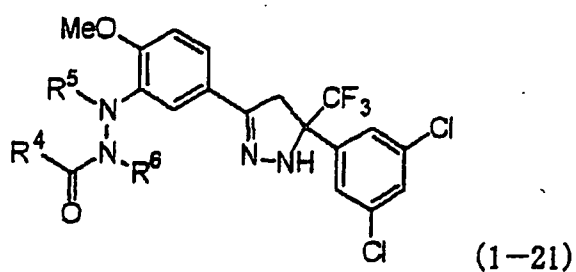
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-20)所表示之化合物：



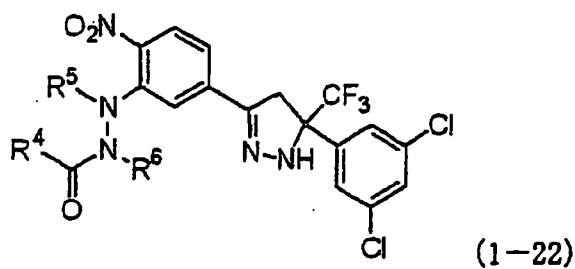
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-21)所表示之化合物：



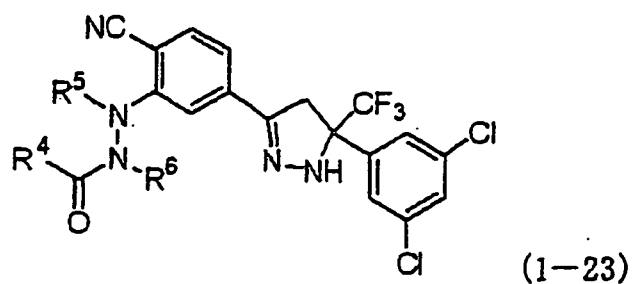
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-22)所表示之化合物：



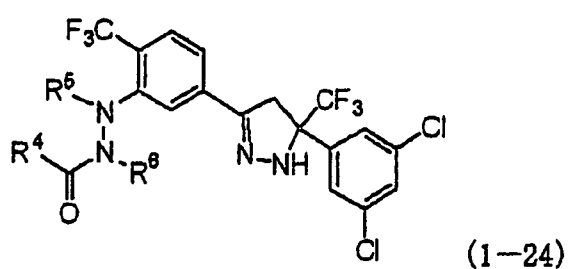
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-23)所表示之化合物：



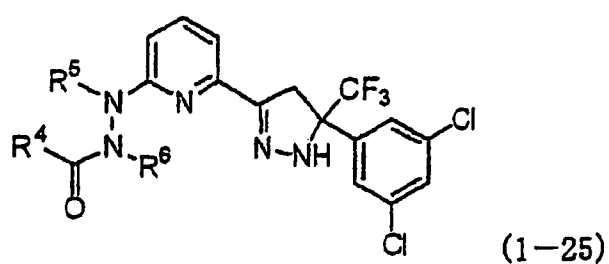
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-24)所表示之化合物：



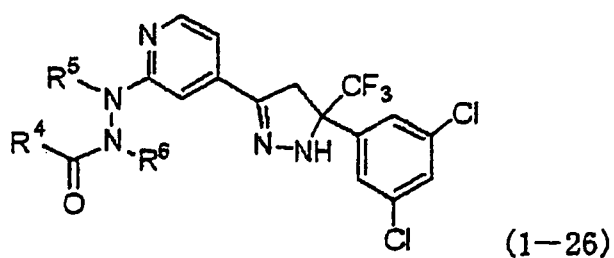
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-25)所表示之化合物：



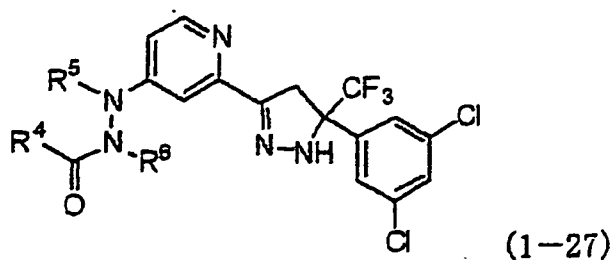
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-26)所表示之化合物：



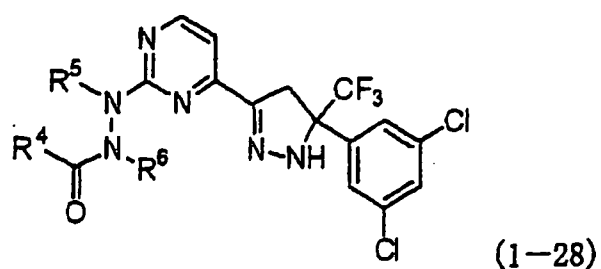
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-27)所表示之化合物：



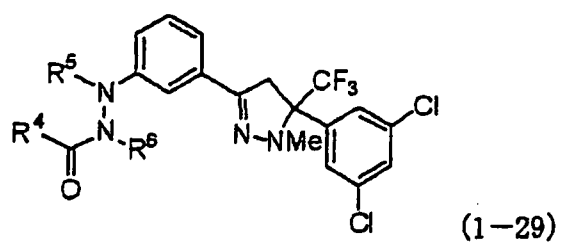
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-28)所表示之化合物：



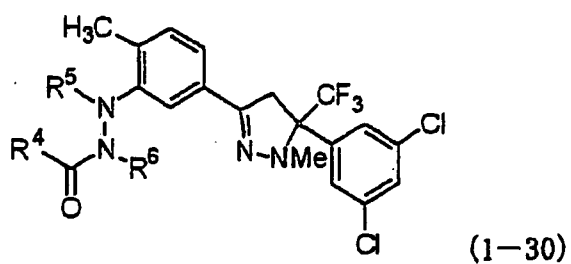
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-29)所表示之化合物：



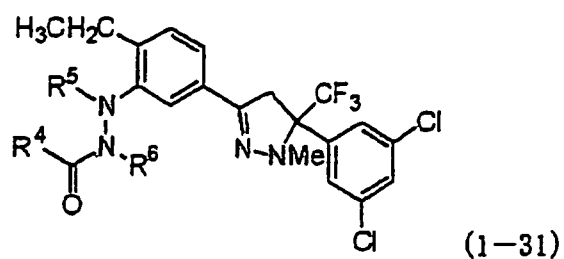
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-30)所表示之化合物：



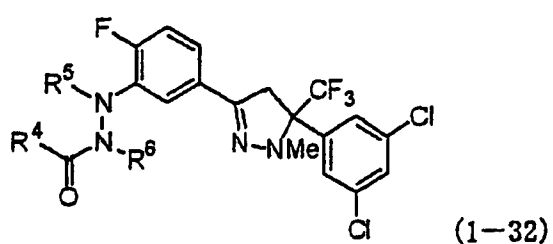
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-31)所表示之化合物：



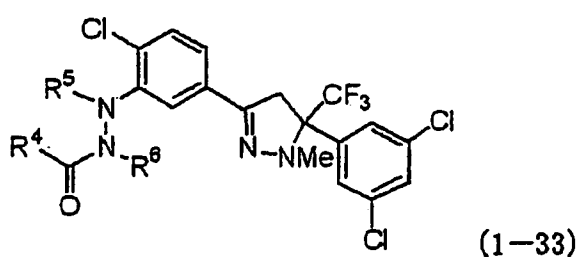
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-32)所表示之化合物：



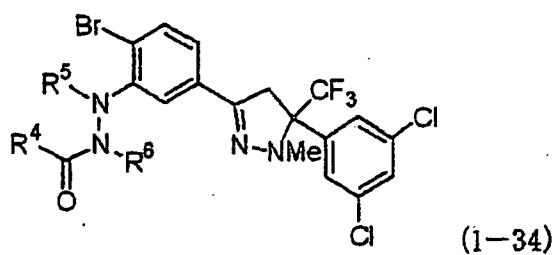
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-33)所表示之化合物：



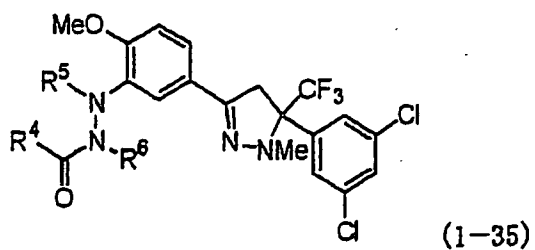
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-34)所表示之化合物：



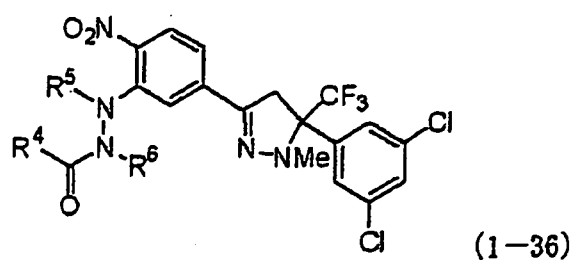
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-35)所表示之化合物：



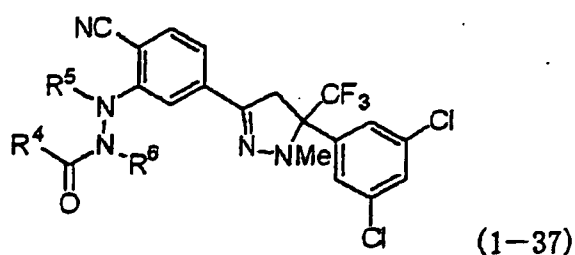
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-36)所表示之化合物：



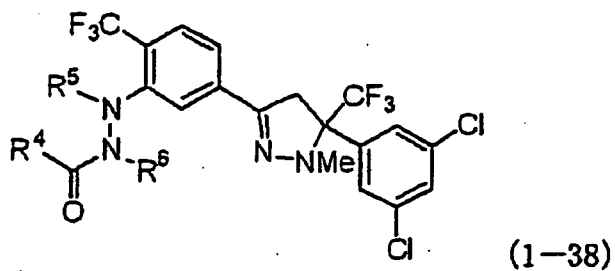
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-37)所表示之化合物：



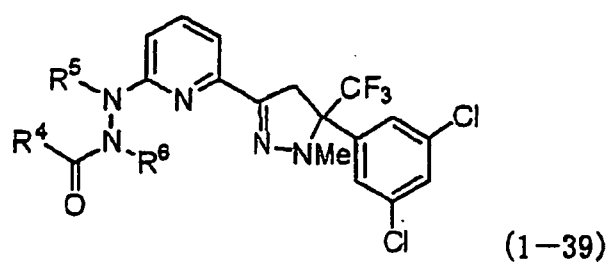
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-38)所表示之化合物：



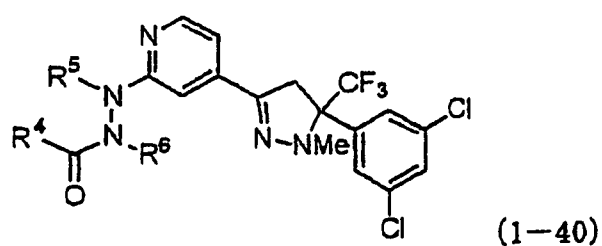
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-39)所表示之化合物：



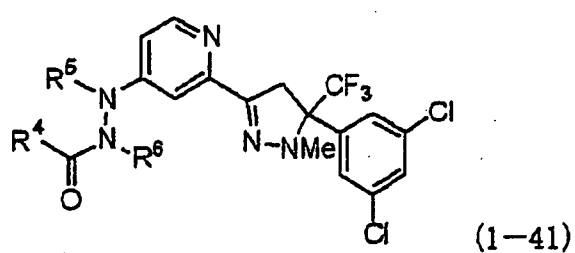
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-40)所表示之化合物：



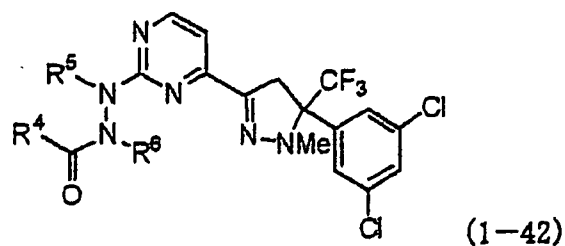
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-41)所表示之化合物：



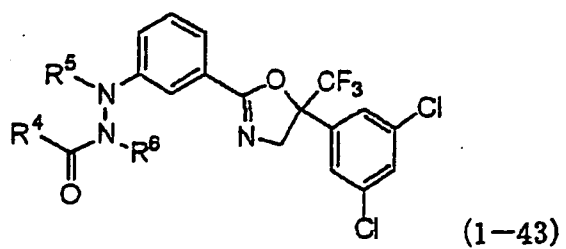
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-42)所表示之化合物：



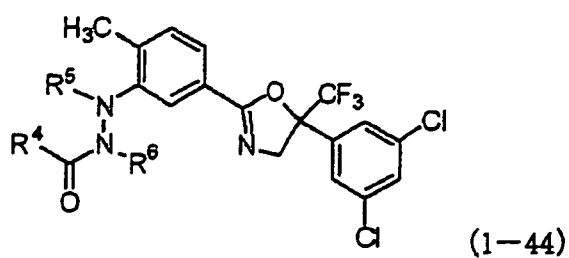
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-43)所表示之化合物：



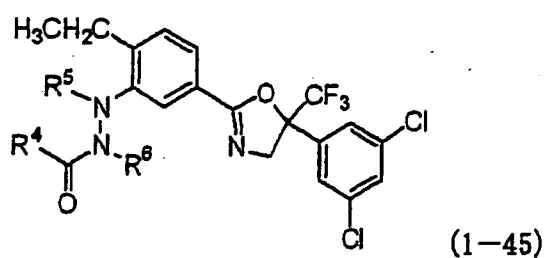
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-44)所表示之化合物：



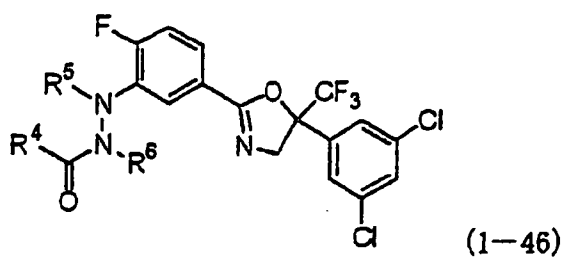
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-45)所表示之化合物：



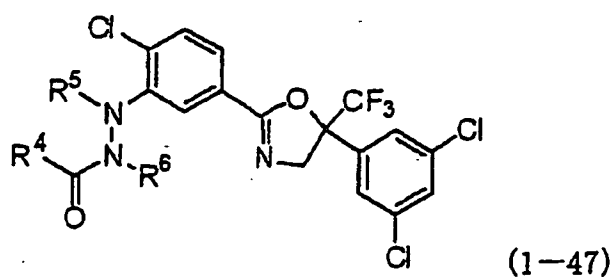
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-46)所表示之化合物：



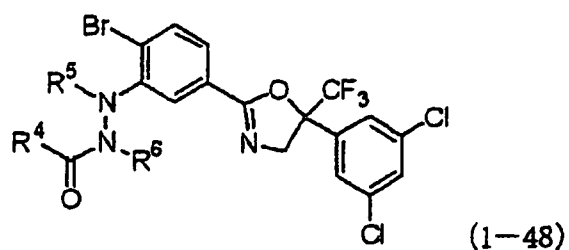
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-47)所表示之化合物：



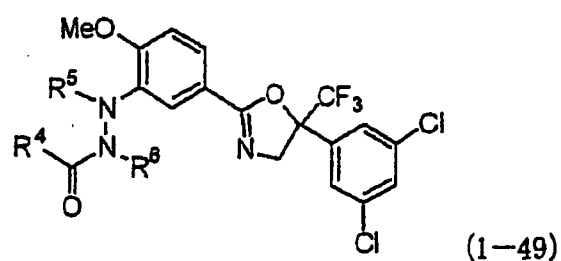
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-48)所表示之化合物：



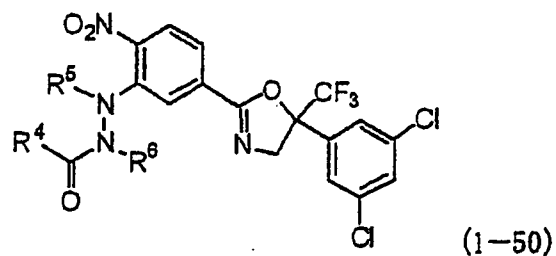
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-49)所表示之化合物：



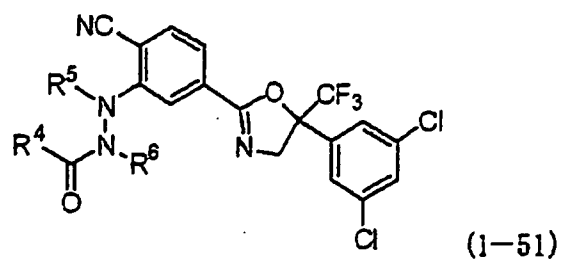
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-50)所表示之化合物：



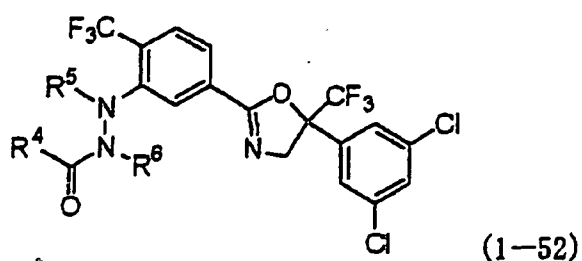
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-51)所表示之化合物：



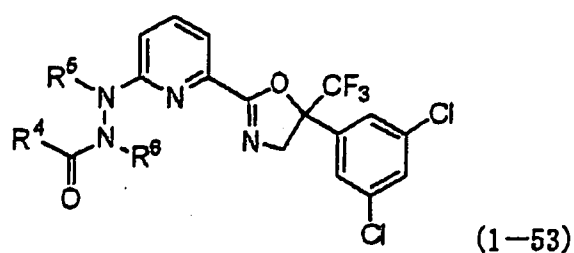
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-52)所表示之化合物：



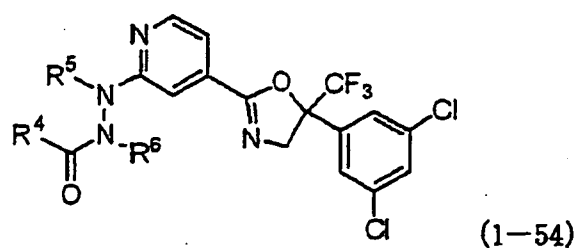
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-53)所表示之化合物：



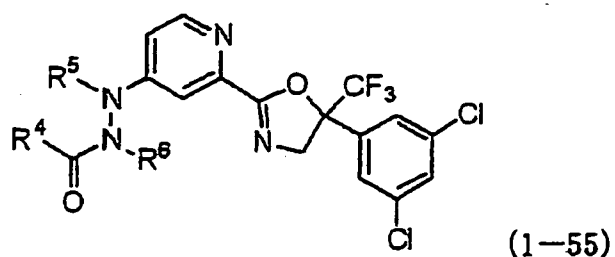
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-54)所表示之化合物：



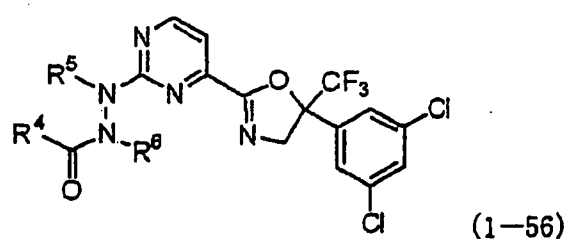
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-55)所表示之化合物：



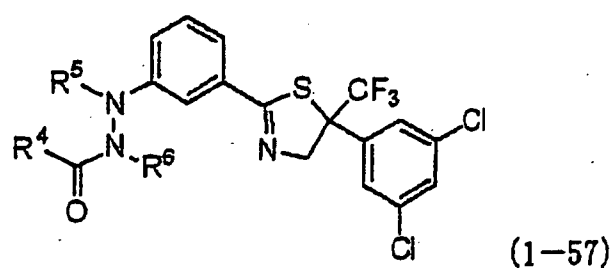
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-56)所表示之化合物：



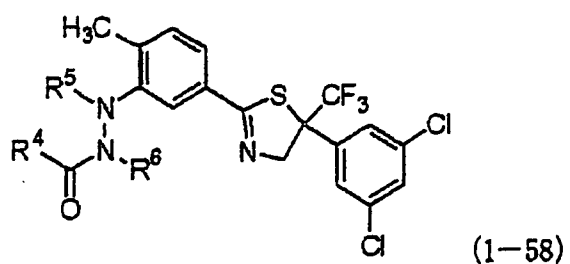
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-57)所表示之化合物：



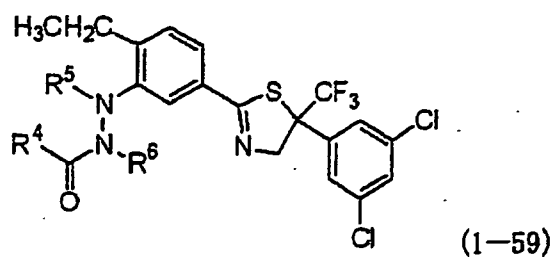
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-58)所表示之化合物：



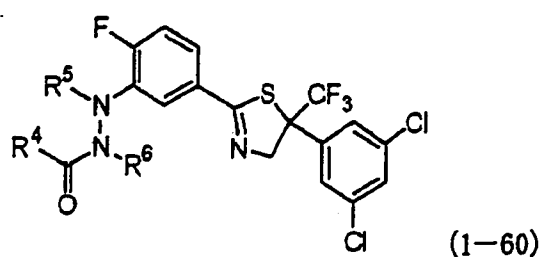
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-59)所表示之化合物：



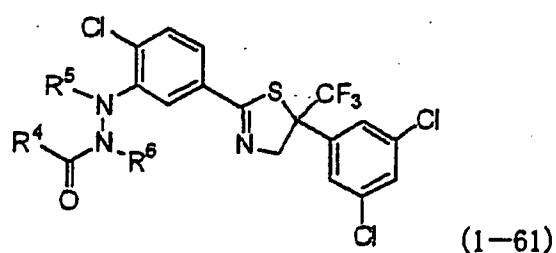
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-60)所表示之化合物：



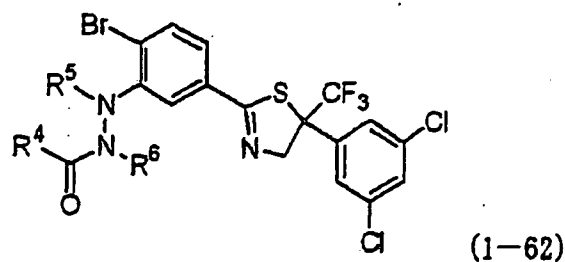
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-61)所表示之化合物：



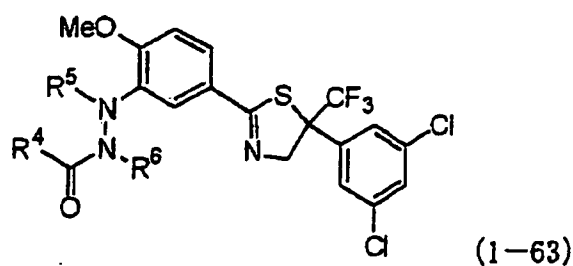
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-62)所表示之化合物：



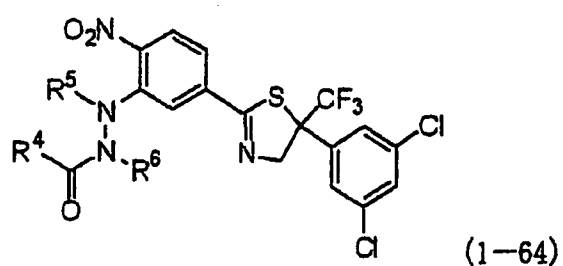
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-63)所表示之化合物：



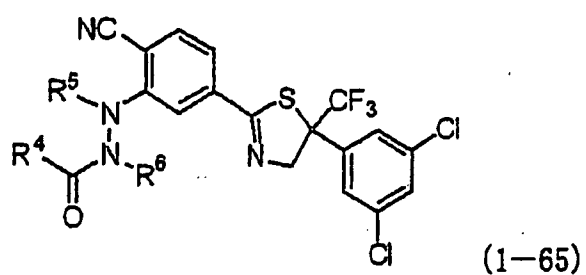
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-64)所表示之化合物：



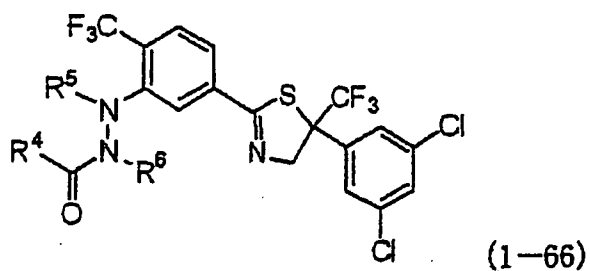
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-65)所表示之化合物：



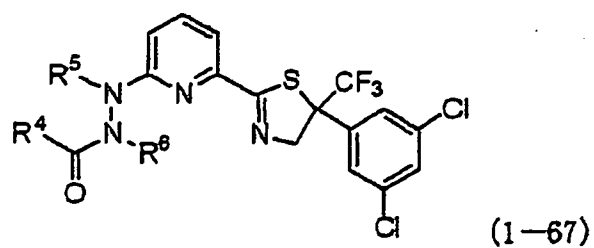
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-66)所表示之化合物：



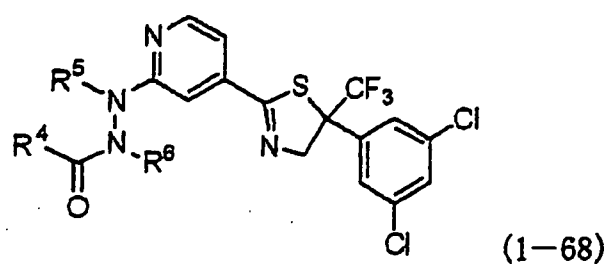
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-67)所表示之化合物：



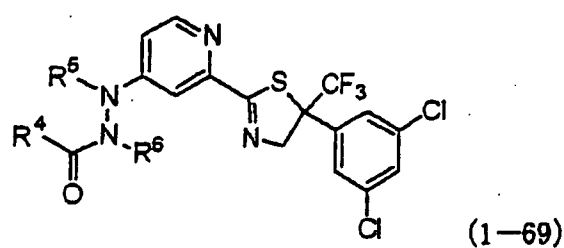
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-68)所表示之化合物：



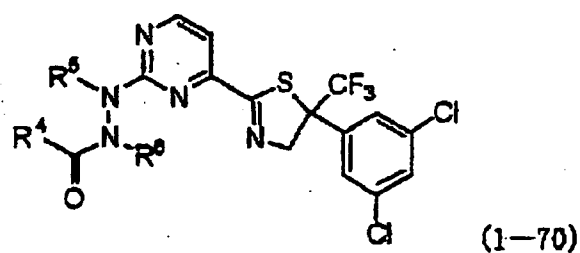
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-69)所表示之化合物：



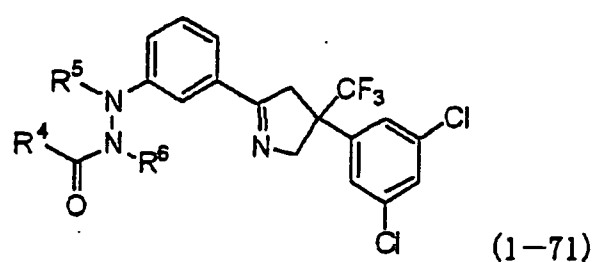
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-70)所表示之化合物：



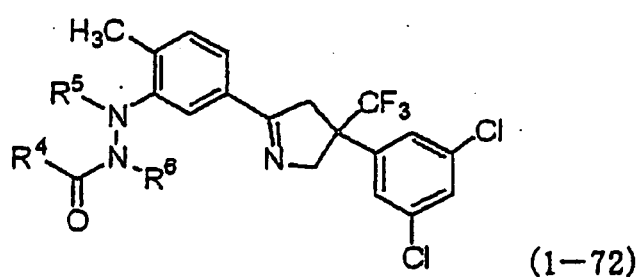
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-71)所表示之化合物：



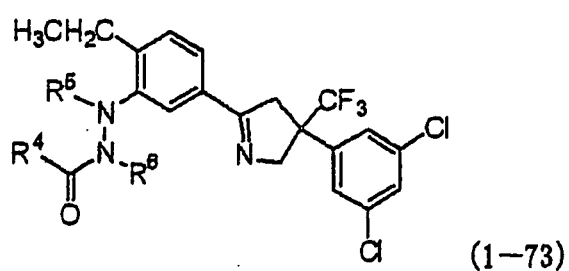
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-72)所表示之化合物：



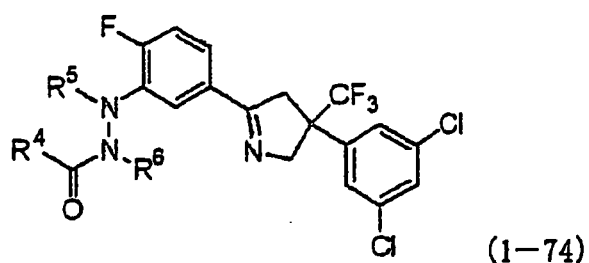
式中，R⁴、R⁵及 R⁶表示下文所示組合之任一者。

式(1-73)所表示之化合物：



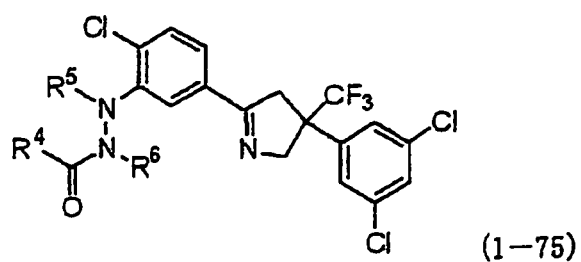
式中，R⁴、R⁵及 R⁶表示下文所示組合之任一者。

式(1-74)所表示之化合物：



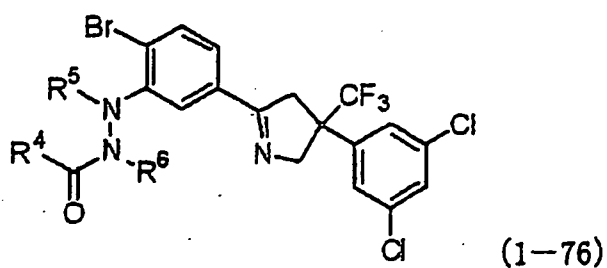
式中，R⁴、R⁵及 R⁶表示下文所示組合之任一者。

式(1-75)所表示之化合物：



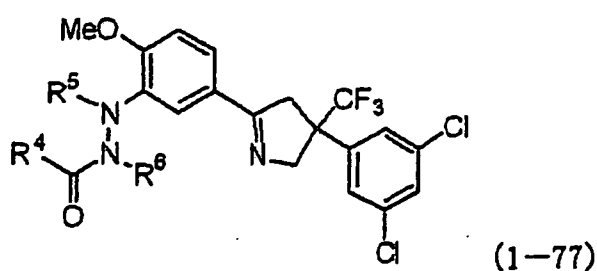
式中，R⁴、R⁵及 R⁶表示下文所示組合之任一者。

式(1-76)所表示之化合物：



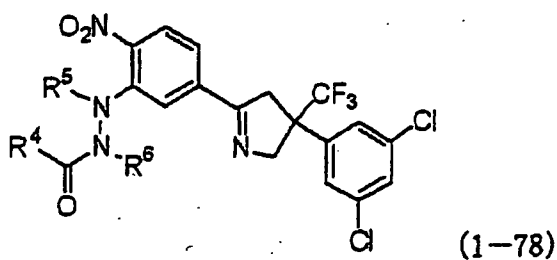
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-77)所表示之化合物：



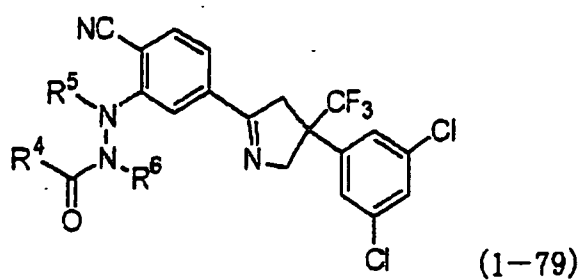
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-78)所表示之化合物：



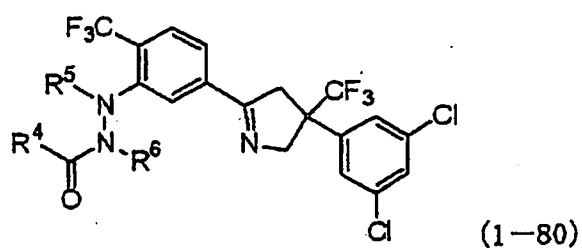
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-79)所表示之化合物：



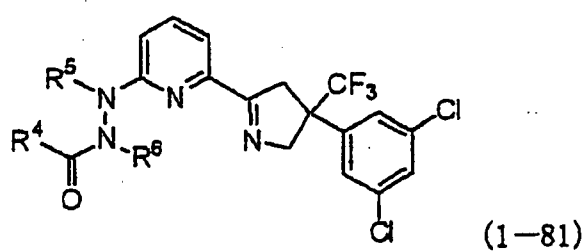
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-80)所表示之化合物：



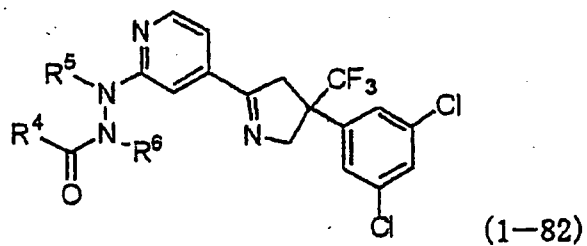
式中，R⁴、R⁵及R⁶表示下文所示組合之任一者。

式(1-81)所表示之化合物：



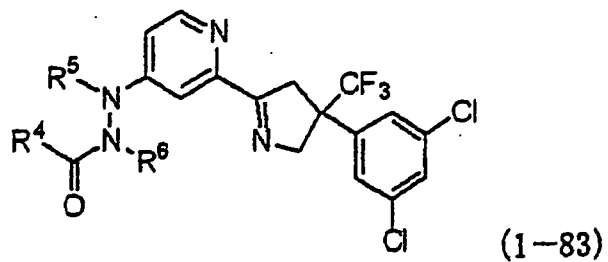
式中，R⁴、R⁵及R⁶表示下文所示組合之任一者。

式(1-82)所表示之化合物：



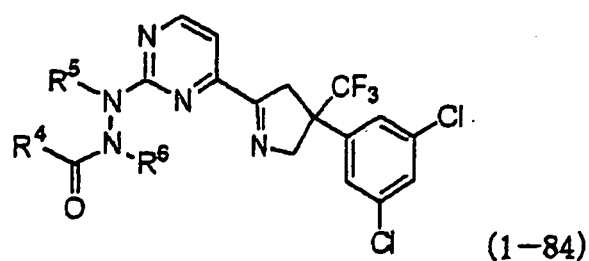
式中，R⁴、R⁵及R⁶表示下文所示組合之任一者。

式(1-83)所表示之化合物：



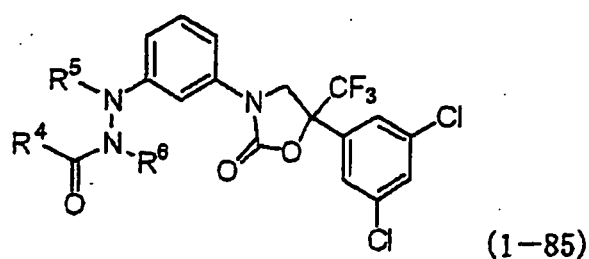
式中，R⁴、R⁵及R⁶表示下文所示組合之任一者。

式(1-84)所表示之化合物：



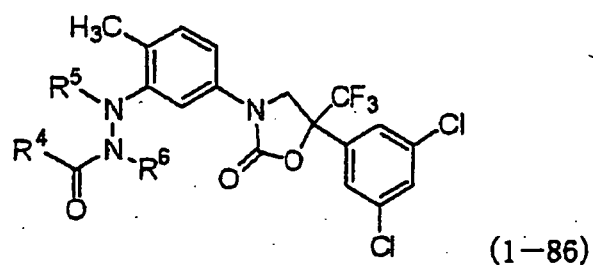
式中，R⁴、R⁵及R⁶表示下文所示組合之任一者。

式(1-85)所表示之化合物：



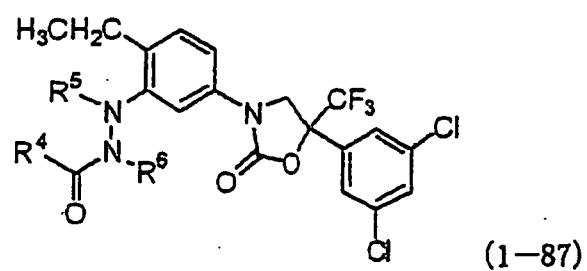
式中，R⁴、R⁵及R⁶表示下文所示組合之任一者。

式(1-86)所表示之化合物：



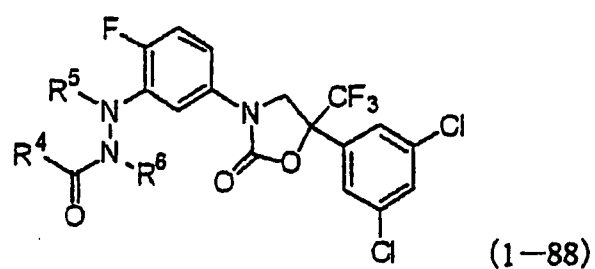
式中，R⁴、R⁵及R⁶表示下文所示組合之任一者。

式(1-87)所表示之化合物：



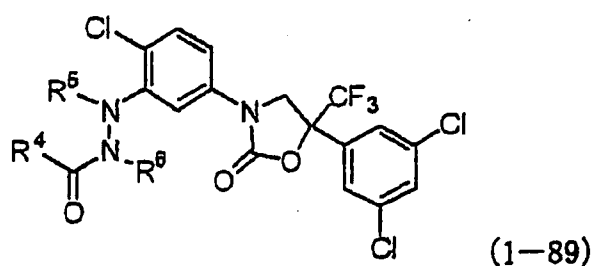
式中，R⁴、R⁵及R⁶表示下文所示組合之任一者。

式(1-88)所表示之化合物：



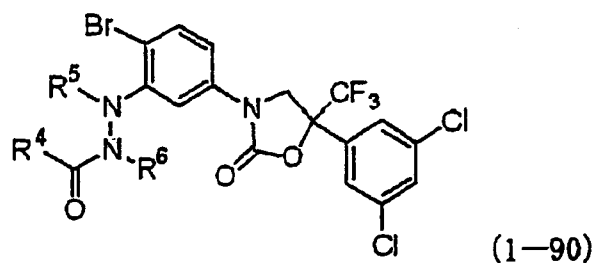
式中，R⁴、R⁵及R⁶表示下文所示組合之任一者。

式(1-89)所表示之化合物：



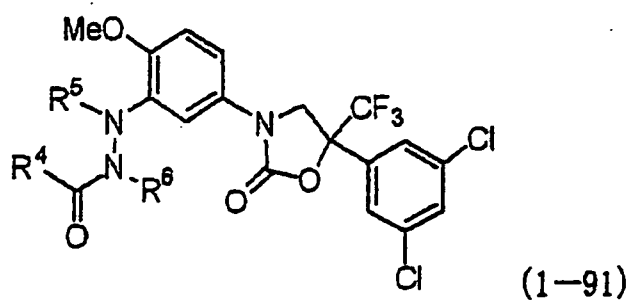
式中，R⁴、R⁵及R⁶表示下文所示組合之任一者。

式(1-90)所表示之化合物：



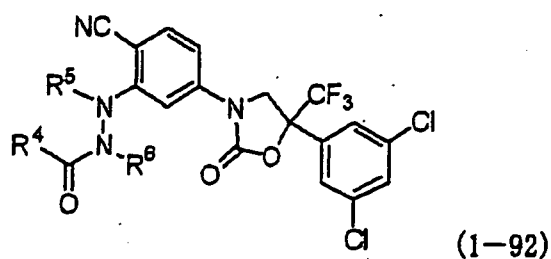
式中，R⁴、R⁵及R⁶表示下文所示組合之任一者。

式(1-91)所表示之化合物：



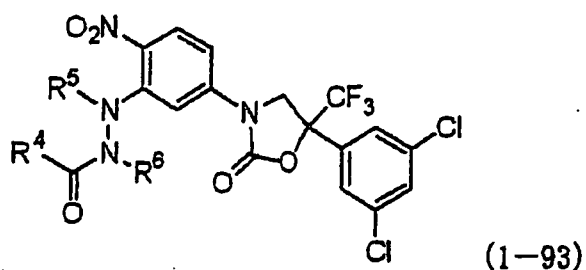
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-92)所表示之化合物：



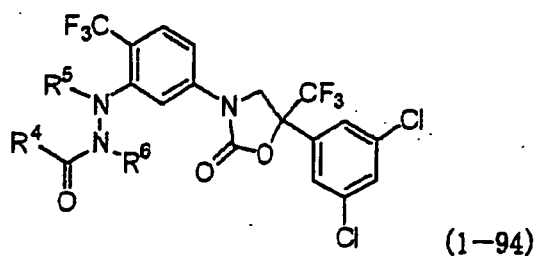
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-93)所表示之化合物：



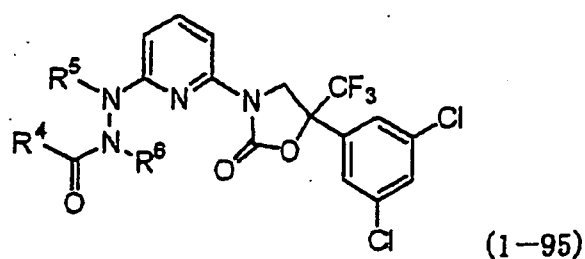
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-94)所表示之化合物：



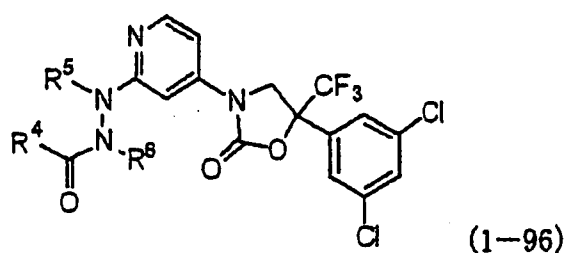
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-95)所表示之化合物：



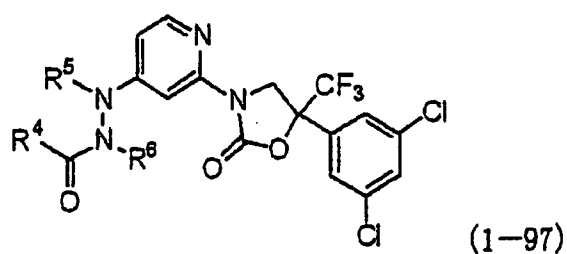
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-96)所表示之化合物：



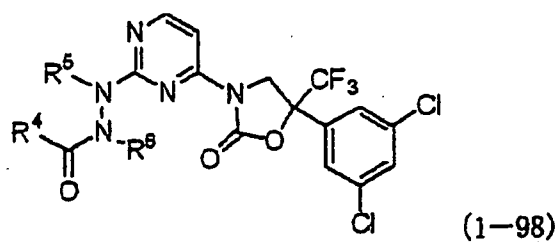
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-97)所表示之化合物：



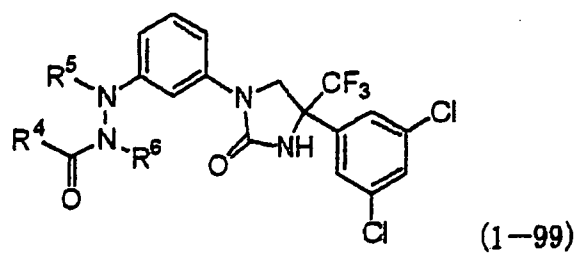
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-98)所表示之化合物：



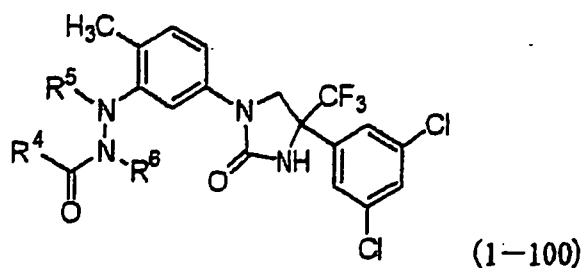
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-99)所表示之化合物：



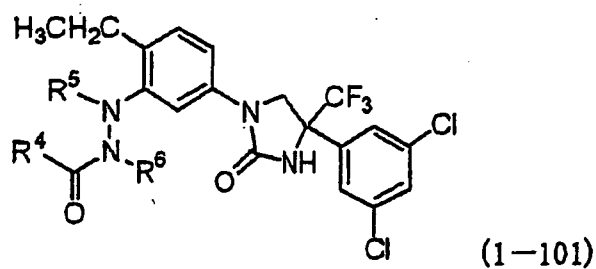
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-100)所表示之化合物：



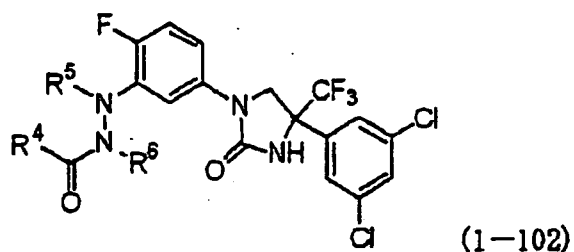
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-101)所表示之化合物：



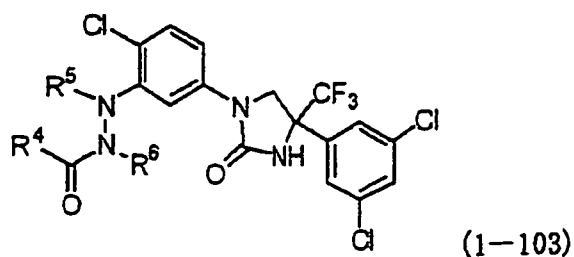
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-102)所表示之化合物：



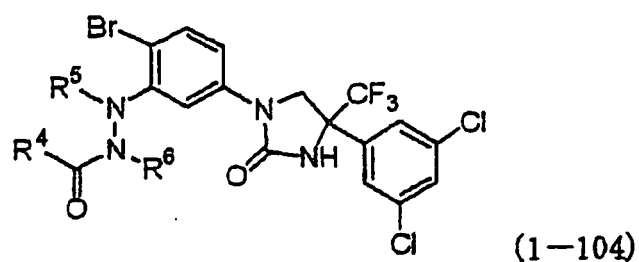
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-103)所表示之化合物：



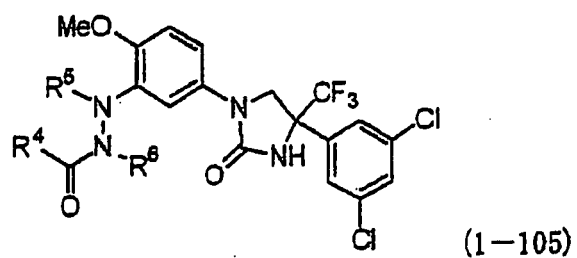
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-104)所表示之化合物：



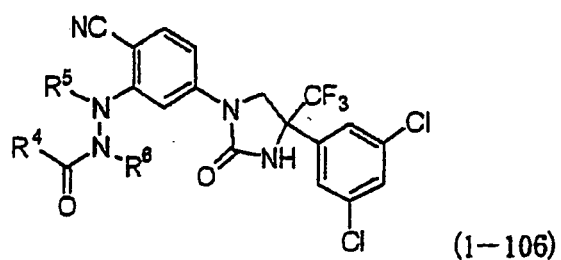
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-105)所表示之化合物：



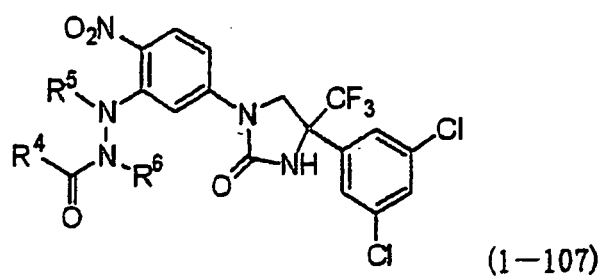
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-106)所表示之化合物：



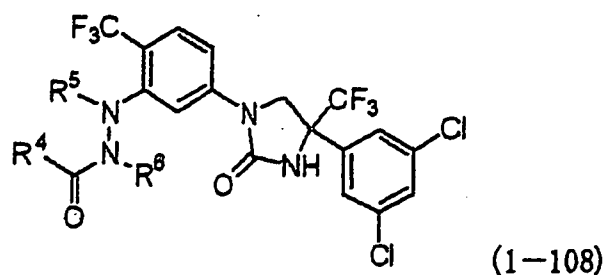
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-107)所表示之化合物：



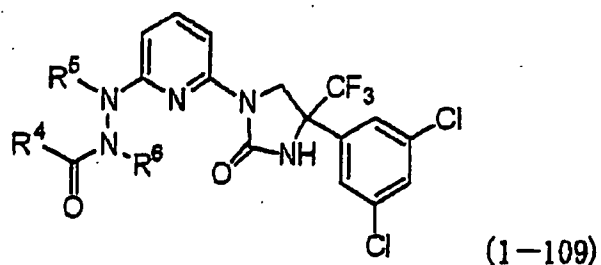
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-108)所表示之化合物：



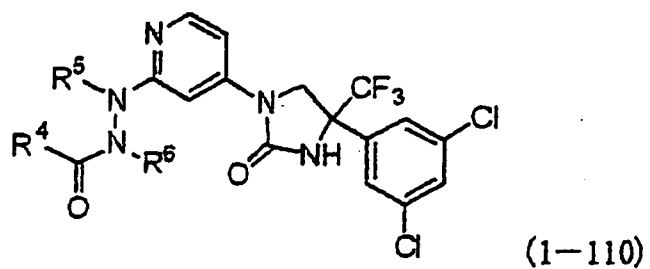
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-109)所表示之化合物：



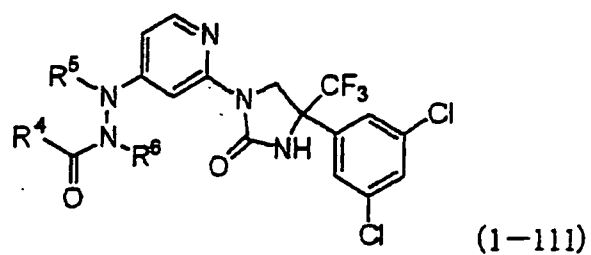
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-110)所表示之化合物：



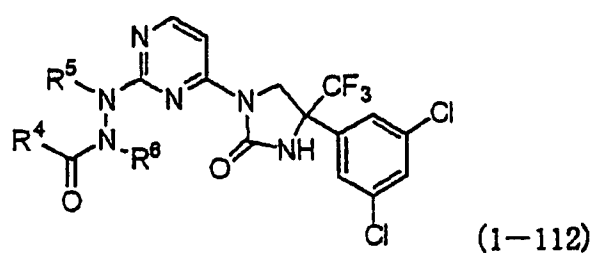
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-111)所表示之化合物：



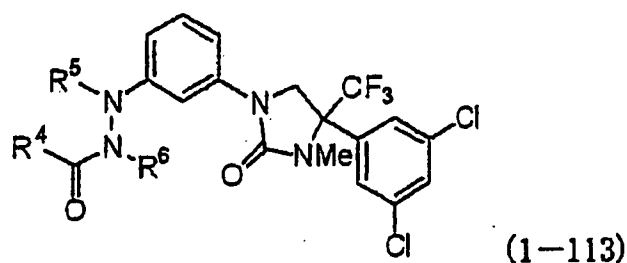
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-112)所表示之化合物：



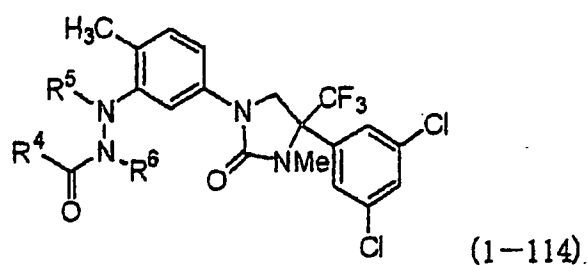
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-113)所表示之化合物：



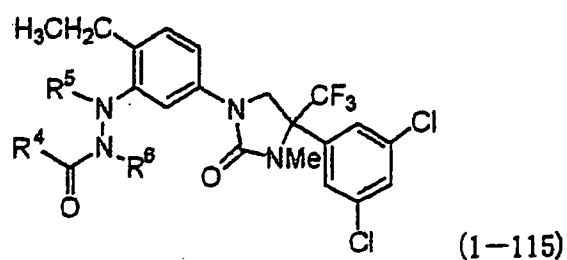
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-114)所表示之化合物：



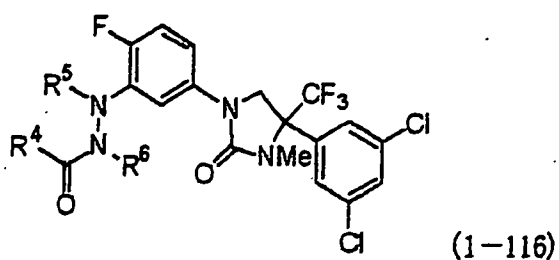
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-115)所表示之化合物：



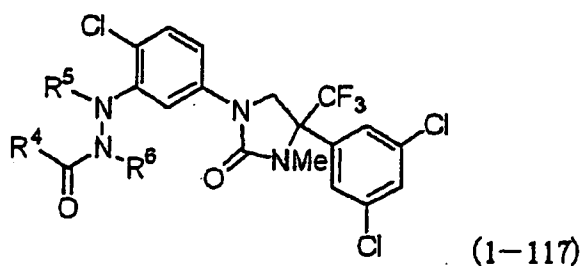
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-116)所表示之化合物：



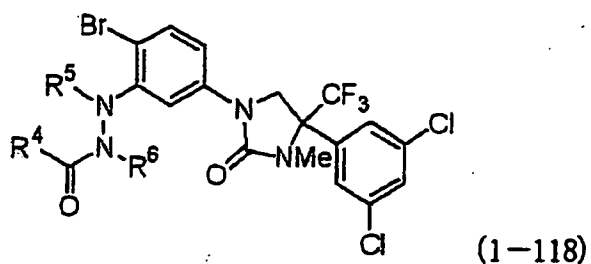
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-117)所表示之化合物：



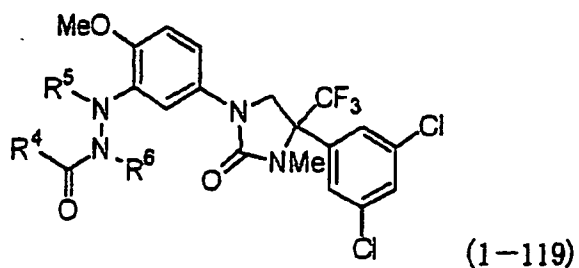
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-118)所表示之化合物：



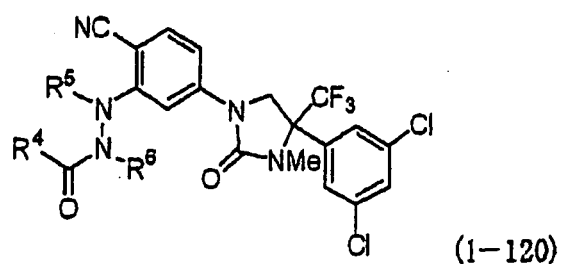
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-119)所表示之化合物：



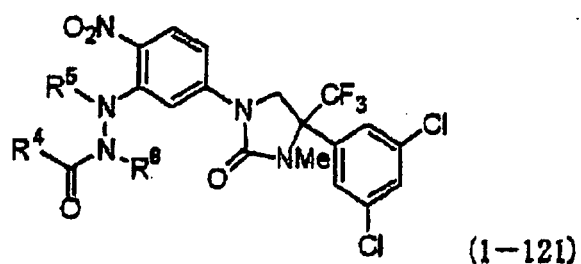
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-120)所表示之化合物：



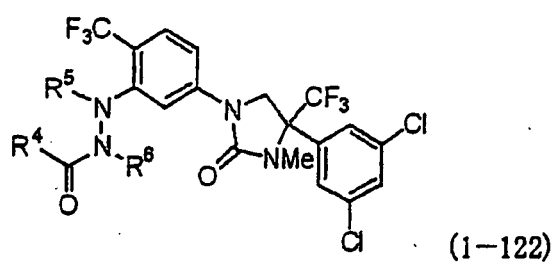
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-121)所表示之化合物：



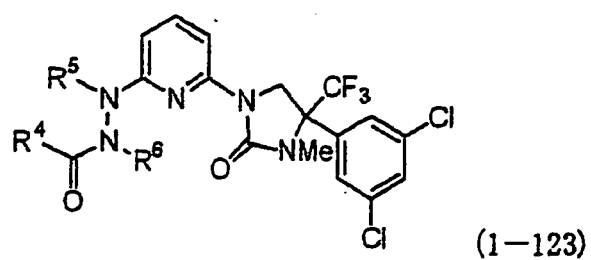
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-122)所表示之化合物：



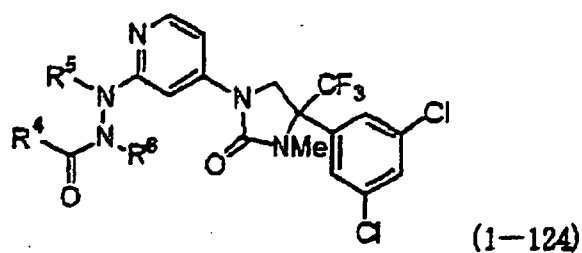
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-123)所表示之化合物：



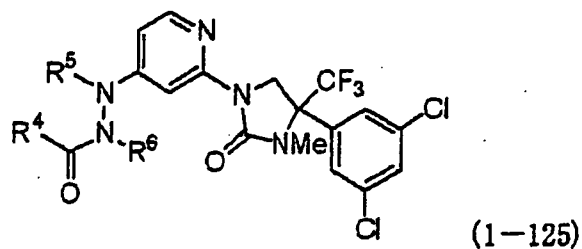
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-124)所表示之化合物：



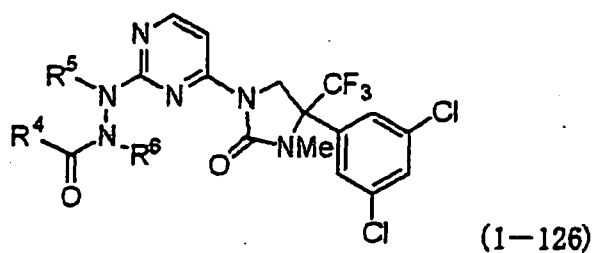
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-125)所表示之化合物：



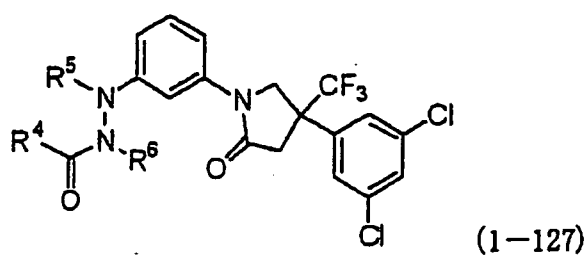
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-126)所表示之化合物：



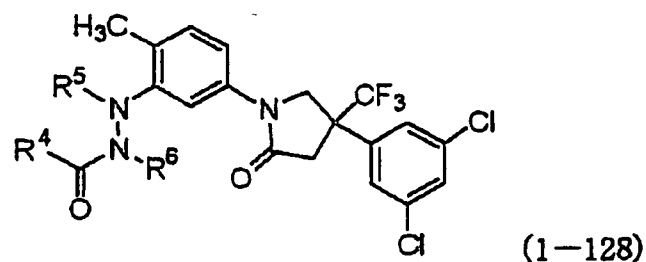
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-127)所表示之化合物：



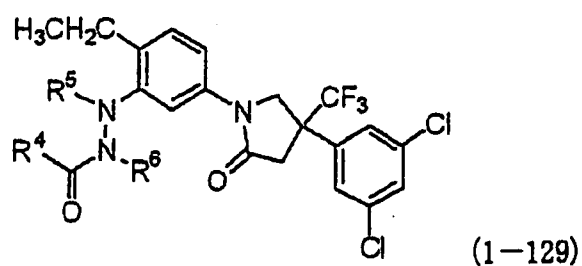
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-128)所表示之化合物：



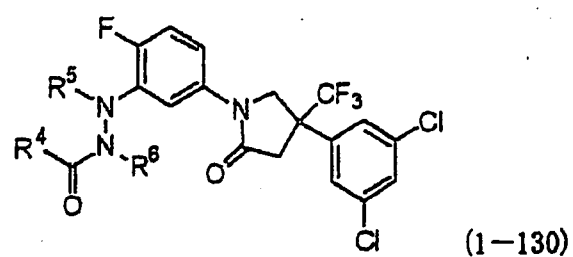
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-129)所表示之化合物：



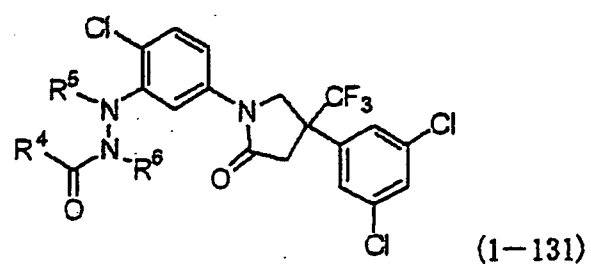
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-130)所表示之化合物：



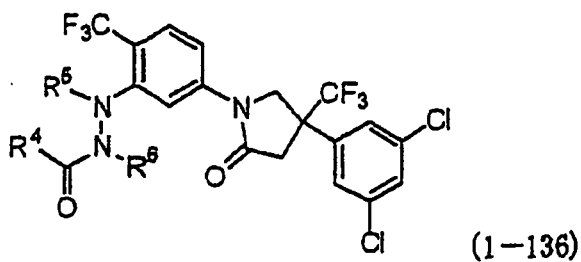
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-131)所表示之化合物：



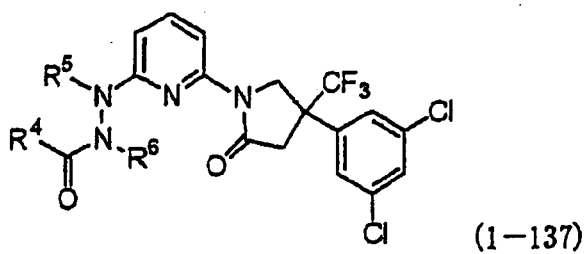
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-136)所表示之化合物：



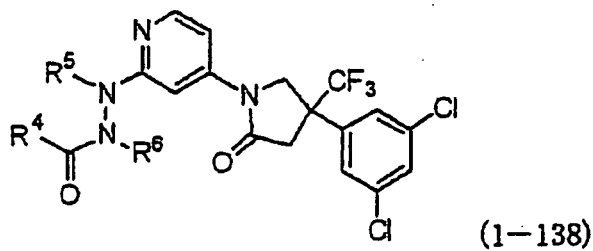
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-137)所表示之化合物：



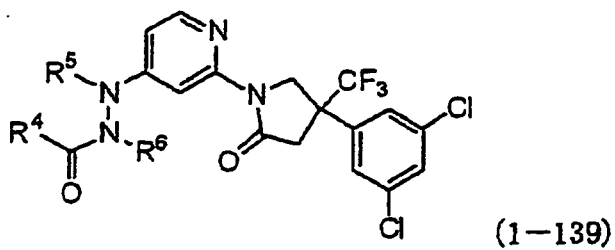
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-138)所表示之化合物：



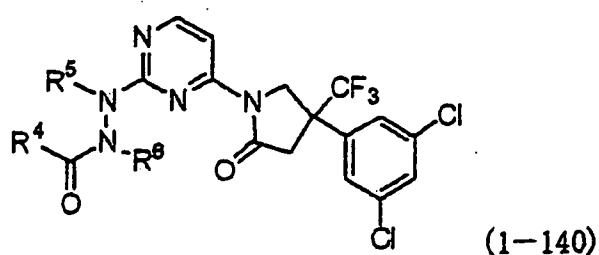
式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-139)所表示之化合物：



式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-140)所表示之化合物：



式中， R^4 、 R^5 及 R^6 表示下文所示組合之任一者。

式(1-1)至式(1-140)中之 A、 R^1 、 R^2 、 R^{1a} 、 R^{2a} 、Q 及 n 之組合係示於下文。於方括弧中，係以如下順序顯示：化合物編號、 R^4 所表示之基團、 R^5 所表示之基團與 R^6 所表示之基團。

[化合物編號， R^4 ， R^5 ， R^6] = [1, H, H, H], [2, CH₃, H, H], [3, CH₂CF₃, H, H], [4, CH=CH₂, H, H], [5, CH=CHPh, H, H], [6, CH₂C≡CH, H, H], [7, CH₂CN, H, H], [8, CH₂NO₂, H, H], [9, CH₂N(CH₃)₂, H, H], [10, CH₂OCH₃, H, H], [11, CH₂OPh, H, H], [12, CH₂C(=O)OCH₃, H, H], [13, CH₂C(=O)CH₃, H, H], [14, CH₂Ph, H, H], [15, A1, H, H], [16, A2, H, H], [17, A3, H, H], [18, A4, H, H], [19, A5, H, H], [20, A6, H, H], [21, Ph, H, H], [22, A7, H, H], [23, A8, H, H], [24, A9, H, H], [25, A10, H, H], [26, OCH₃, H, H], [27, OPh, H, H], [28, NHCH₃, H, H], [29, N(CH₃)₂, H, H], [30, NHPh, H, H], [31, A11, H, H], [32, H, H, CH₃], [33, CH₃, H, CH₃], [34, CH₂CF₃, H, CH₃], [35, CH=CH₂, H, CH₃], [36, CH=CHPh, H, CH₃], [37, CH₂C≡CH, H, CH₃], [38, CH₂CN, H, CH₃], [39, CH₂NO₂, H, CH₃], [40, CH₂N(CH₃)₂, H, CH₃], [41, CH₂OCH₃, H, CH₃], [42, CH₂OPh, H, CH₃], [43, CH₂C(=O)OCH₃, H, CH₃], [44, CH₂C(=O)CH₃, H, CH₃], [45, CH₂Ph, H, CH₃], [46, A1, H, CH₃], [47, A2, H, CH₃], [48, A3, H, CH₃],

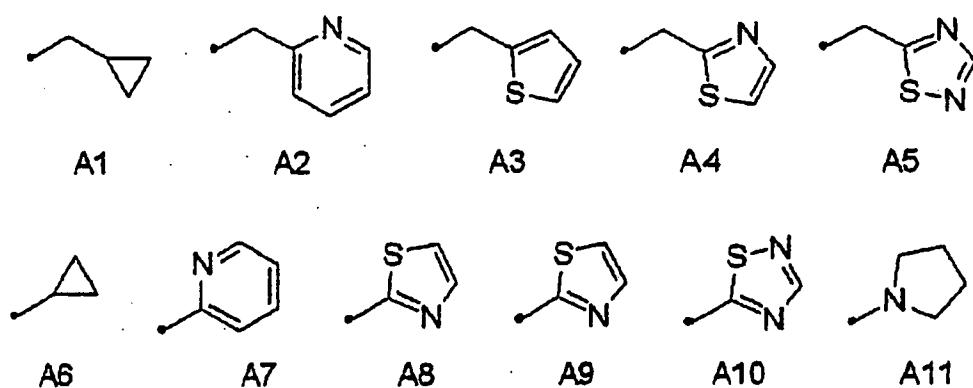
[49, A4, H, CH₃], [50, A5, H, CH₃], [51, A6, H, CH₃], [52, Ph, H, CH₃], [53, A7, H, CH₃], [54, A8, H, CH₃], [55, A9, H, CH₃], [56, A10, H, CH₃], [57, OCH₃, H, CH₃], [58, OPh, H, CH₃], [59, NHCH₃, H, CH₃], [60, N(CH₃)₂, H, CH₃], [61, NHPh, H, CH₃], [62, A11, H, CH₃], [63, H, H, C(=O)CH₃], [64, CH₃, H, C(=O)CH₃], [65, CH₂CF₃, H, C(=O)CH₃], [66, CH=CH₂, H, C(=O)CH₃], [67, CH=CHPh, H, C(=O)CH₃], [68, CH₂C≡CH, H, C(=O)CH₃], [69, CH₂CN, H, C(=O)CH₃], [70, CH₂NO₂, H, C(=O)CH₃], [71, CH₂N(CH₃)₂, H, C(=O)CH₃], [72, CH₂OCH₃, H, C(=O)CH₃], [73, CH₂OPh, H, C(=O)CH₃], [74, CH₂C(=O)OCH₃, H, C(=O)CH₃], [75, CH₂C(=O)CH₃, H, C(=O)CH₃], [76, CH₂Ph, H, C(=O)CH₃], [77, A1, H, C(=O)CH₃], [78, A2, H, C(=O)CH₃], [79, A3, H, C(=O)CH₃], [80, A4, H, C(=O)CH₃], [81, A5, H, C(=O)CH₃], [82, A6, H, C(=O)CH₃], [83, Ph, H, C(=O)CH₃], [84, A7, H, C(=O)CH₃], [85, A8, H, C(=O)CH₃], [86, A9, H, C(=O)CH₃], [87, A10, H, C(=O)CH₃], [88, OCH₃, H, C(=O)CH₃], [89, OPh, H, C(=O)CH₃], [90, NHCH₃, H, C(=O)CH₃], [91, N(CH₃)₂, H, C(=O)CH₃], [92, NHPh, H, C(=O)CH₃], [93, A11, H, C(=O)CH₃], [94, H, CH₃, H], [95, CH₃, CH₃, H], [96, CH₂CF₃, CH₃, H], [97, CH=CH₂, CH₃, H], [98, CH=CHPh, CH₃, H], [99, CH₂C≡CH, CH₃, H], [100, CH₂CN, CH₃, H], [101, CH₂NO₂, CH₃, H], [102, CH₂N(CH₃)₂, CH₃, H], [103, CH₂OCH₃, CH₃, H], [104, CH₂OPh, CH₃, H], [105, CH₂C(=O)OCH₃, CH₃, H], [106, CH₂C(=O)CH₃, CH₃, H], [107, CH₂Ph, CH₃, H], [108, A1, CH₃, H], [109, A2, CH₃, H], [110, A3, CH₃, H], [111, A4, CH₃, H], [112, A5, CH₃, H], [113, A6, CH₃, H], [114, Ph, CH₃, H], [115, A7, CH₃,

H], [116, A8, CH₃, H], [117, A9, CH₃, H], [118, A10, CH₃, H],
[119, OCH₃, CH₃, H], [120, OPh, CH₃, H], [121, NHCH₃, CH₃, H],
[122, N(CH₃)₂, CH₃, H], [123, NHPh, CH₃, H], [124, A11, CH₃, H],
[125, H, CH₃, CH₃], [126, CH₃, CH₃, CH₃], [127, CH₂CF₃, CH₃, CH₃],
[128, CH=CH₂, CH₃, CH₃], [129, CH=CHPh, CH₃, CH₃], [130, CH₂C≡CH,
CH₃, CH₃], [131, CH₂CN, CH₃, CH₃], [132, CH₂NO₂, CH₃, CH₃], [133,
CH₂N(CH₃)₂, CH₃, CH₃], [134, CH₂OCH₃, CH₃, CH₃], [135, CH₂OPh, CH₃,
CH₃], [136, CH₂C(=O)OCH₃, CH₃, CH₃], [137, CH₂C(=O)CH₃, CH₃, CH₃],
[138, CH₂Ph, CH₃, CH₃], [139, A1, CH₃, CH₃], [140, A2, CH₃, CH₃],
[141, A3, CH₃, CH₃], [142, A4, CH₃, CH₃], [143, A5, CH₃, CH₃],
[144, A6, CH₃, CH₃], [145, Ph, CH₃, CH₃], [146, A7, CH₃, CH₃],
[147, A8, CH₃, CH₃], [148, A9, CH₃, CH₃], [149, A10, CH₃, CH₃],
[150, OCH₃, CH₃, CH₃], [151, OPh, CH₃, CH₃], [152, NHCH₃, CH₃,
CH₃], [153, N(CH₃)₂, CH₃, CH₃], [154, NHPh, CH₃, CH₃], [155, A11,
CH₃, CH₃], [156, H, CH₃, C(=O)CH₃], [157, CH₃, CH₃, C(=O)CH₃],
[158, CH₂CF₃, CH₃, C(=O)CH₃], [159, CH=CH₂, CH₃, C(=O)CH₃], [160,
CH=CHPh, CH₃, C(=O)CH₃], [161, CH₂C≡CH, CH₃, C(=O)CH₃], [162,
CH₂CN, CH₃, C(=O)CH₃], [163, CH₂NO₂, CH₃, C(=O)CH₃], [164,
CH₂N(CH₃)₂, CH₃, C(=O)CH₃], [165, CH₂OCH₃, CH₃, C(=O)CH₃], [166,
CH₂OPh, CH₃, C(=O)CH₃], [167, CH₂C(=O)OCH₃, CH₃, C(=O)CH₃], [168,
CH₂C(=O)CH₃, CH₃, C(=O)CH₃], [169, CH₂Ph, CH₃, C(=O)CH₃], [170,
A1, CH₃, C(=O)CH₃], [171, A2, CH₃, C(=O)CH₃], [172, A3, CH₃,
C(=O)CH₃], [173A4, CH₃, C(=O)CH₃], [174, A5, CH₃, C(=O)CH₃], [175,
A6, CH₃, C(=O)CH₃], [176, Ph, CH₃, C(=O)CH₃], [177, A7, CH₃,
C(=O)CH₃], [178, A8, CH₃, C(=O)CH₃], [179, A9, CH₃, C(=O)CH₃],

[180, A10, CH₃, C(=O)CH₃], [181, OCH₃, CH₃, C(=O)CH₃], [182, OPh, CH₃, C(=O)CH₃], [183, NHCH₃, CH₃, C(=O)CH₃], [184, N(CH₃)₂, CH₃, C(=O)CH₃], [185, NHPh, CH₃, C(=O)CH₃], [186, A11, CH₃, C(=O)CH₃], [187, H, C(=O)CH₃, H], [188, CH₃, C(=O)CH₃, H], [189, CH₂CF₃, C(=O)CH₃, H], [190, CH=CH₂, C(=O)CH₃, H], [191, CH=CHPh, C(=O)CH₃, H], [192, CH₂C≡CH, C(=O)CH₃, H], [193, CH₂CN, C(=O)CH₃, H], [194, CH₂NO₂, C(=O)CH₃, H], [195, CH₂N(CH₃)₂, C(=O)CH₃, H], [196, CH₂OCH₃, C(=O)CH₃, H], [197, CH₂OPh, C(=O)CH₃, H], [198, CH₂C(=O)OCH₃, C(=O)CH₃, H], [199, CH₂C(=O)CH₃, C(=O)CH₃, H], [200, CH₂Ph, C(=O)CH₃, H], [201, A1, C(=O)CH₃, H], [202, A2, C(=O)CH₃, H], [203, A3, C(=O)CH₃, H], [204, A4, C(=O)CH₃, H], [205, A5, C(=O)CH₃, H], [206, A6, C(=O)CH₃, H], [207, Ph, C(=O)CH₃, H], [208, A7, C(=O)CH₃, H], [209, A8, C(=O)CH₃, H], [210, A9, C(=O)CH₃, H], [211, A10, C(=O)CH₃, H], [212, OCH₃, C(=O)CH₃, H], [213, OPh, C(=O)CH₃, H], [214, NHCH₃, C(=O)CH₃, H], [215, N(CH₃)₂, C(=O)CH₃, H], [216, NHPh, C(=O)CH₃, H], [217, A11, C(=O)CH₃, H], [218, H, C(=O)CH₃, CH₃], [219, CH₃, C(=O)CH₃, CH₃], [220, CH₂CF₃, C(=O)CH₃, CH₃], [221, CH=CH₂, C(=O)CH₃, CH₃], [222, CH=CHPh, C(=O)CH₃, CH₃], [223, CH₂C≡CH, C(=O)CH₃, CH₃], [224, CH₂CN, C(=O)CH₃, CH₃], [225, CH₂NO₂, C(=O)CH₃, CH₃], [226, CH₂N(CH₃)₂, C(=O)CH₃, CH₃], [227, CH₂OCH₃, C(=O)CH₃, CH₃], [228, CH₂OPh, C(=O)CH₃, CH₃], [229, CH₂C(=O)OCH₃, C(=O)CH₃, CH₃], [230, CH₂C(=O)CH₃, C(=O)CH₃, CH₃], [231, CH₂Ph, C(=O)CH₃, CH₃], [232, A1, C(=O)CH₃, CH₃], [233, A2, C(=O)CH₃, CH₃], [234, A3, C(=O)CH₃,

CH_3], [235, A4, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, CH_3], [236, A5, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, CH_3], [237, A6, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, CH_3], [238, Ph, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, CH_3], [239, A7, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, CH_3], [240, A8, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, CH_3], [241, A9, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, CH_3], [242, A10, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, CH_3], [243, OCH_3 , $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, CH_3], [244, OPh, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, CH_3], [245, NHCH_3 , $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, CH_3], [246, $\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, CH_3], [247, NHPh , $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, CH_3], [248, A11, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, CH_3], [249, H, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [250, CH_3 , $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [251, CH_2CF_3 , $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [252, $\text{CH}=\text{CH}_2$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [253, $\text{CH}=\text{CHPh}$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [254, $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [255, CH_2CN , $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [256, CH_2NO_2 , $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [257, $\text{CH}_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [258, CH_2OCH_3 , $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [259, CH_2OPh , $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [260, $\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{OCH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [261, $\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [262, CH_2Ph , $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [263, A1, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [264, A2, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [265, A3, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [266, A4, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [267, A5, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [268, A6, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [269, Ph, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [270, A7, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [271, A8, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [272, A9, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [273, A10, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [274, OCH_3 , $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [275, OPh, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [276, NHCH_3 , $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [277, $\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [278, NHPh , $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$], [279, A11, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$, $\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$].

其中，A1 至 A11 表示下述基團：



調配例顯示於下文。用語「份」意指重量份。

調配例 1

將 9 份本發明化合物(1)至(63)之任一者溶於 37.5 份二甲苯及 37.5 份 N,N-二甲基甲醯胺中。對其添加 10 份聚氧伸乙基苯乙烯基苯基醚及 6 份十二烷基苯磺酸鈣，經攪拌以徹底混合，獲得乳化濃縮物。

調配例 2

對 40 份本發明化合物(1)至(63)之任一者，添加 5 份 SORPOL 5060(東邦化學工業公司(TOHO Chemical Industry Co., Ltd.)之註冊商標)並徹底混合。混合物經使用果汁機與 32 份 CARPLEX #80(鹽野義製藥(Shionogi & CO., Ltd.)之註冊商標，為合成性水合氧化矽細粉)及 23 份 300 網眼之矽藻土混合，獲得可濕性粉劑。

調配例 3

將 3 份本發明化合物(1)至(63)之任一者、5 份合成性水合氧化矽細粉、5 份十二烷基苯磺酸鈉、30 份膨潤土及 57 份黏土經攪拌以徹底混合。添加適當量之水至此混合物中。進一步攪拌該混合物，以製粒機製粒，然後再經風乾，

獲得粒劑。

調配例 4

將 4.5 份本發明化合物(1)至(63)之任一者、1 份合成性水合氧化矽細粉、1 份作為絮凝劑之 Dorires B(由 Sankyo 製造)、及 7 份黏土以礮碁(mortar)徹底混合，然後再以果汁機攪拌而混合。添加 86.5 份經切割之黏土至所得混合物中，經攪拌徹底而混合，獲得粉劑。

調配例 5

將 10 份本發明化合物(1)至(63)之任一者、35 份之聚氧伸乙基烷基醚硫酸銨鹽與白碳(重量比 1:1)之混合物、以及 55 份水予以混合後，藉由濕氏研磨法予以碎粒化而獲得調配物。

調配例 6

將 0.5 份本發明化合物(1)至(63)之任一者溶於 10 份二氯甲烷中。將此溶液與 89.5 份 Isopar M(異烷烴: Exxon Chemical 公司之註冊商標)混合，獲得油狀溶液。

調配例 7

將 0.1 份本發明化合物(1)至(63)之任一者及 49.9 份 NEO-THIOZOL(Chuo Kasei Co., Ltd.)置於氣霧罐中。於該罐加裝氣霧閥。將 25 份甲醚及 25 份 LPG 填充至罐中，然後震盪。於該罐安裝致動器，獲得油性氣霧劑。

調配例 8

將 0.6 份本發明化合物(1)至(63)之任一者、0.01 份 BHT、5 份二甲苯、3.39 份脫臭煤油及 1 份乳化劑[Atmos 300

(Atmos 化學公司之註冊商標)]混合，獲得溶液。於氣霧劑容器填充所得之溶液及 50 份蒸餾水。於該容器加裝閥門零件，然後在減壓下透過該閥門填充 40 份推進劑(LPG)至該容器中，獲得水性氣霧劑。

下述試驗例證實本發明化合物有效於作為有害生物防治組成物之活性成分。本發明化合物係標示如上文所示之化合物編號。

試驗例 1

根據調配例 5 獲得本發明某些化合物的調配物。該調配物以水稀釋以製得活性成分為 500ppm 之試驗溶液。

在直徑 5.5 公分之聚乙烯杯的杯底鋪設直徑 5.5 公分的濾紙，再滴加 0.7mL 試驗溶液到該濾紙上。將 30mg 蔗糖作為誘餌均勻地放置在該濾紙上。釋放 10 隻雌性普通家蠅 (*Musca domestica*) 成蟲到該聚乙烯杯內並以蓋子密封。24 小時後，計算普通家蠅存活數目並根據下述公式計算該有害生物死亡率。

有害生物死亡率(%)=(死亡成蠅數目/試驗成蠅數目)×100

結果，經本發明化合物(1)、(7)、(8)、(10)、(11)、(15)、(17)至(20)、(23)、(28)至(32)、(36)、(38)、(40)及(42)至(44)中之任一者處理，有害生物之死亡率顯示為 100%。

試驗例 2

根據調配例 5 獲得本發明某些化合物的調配物。該調配物以水稀釋以製得活性成分為 500 ppm 之試驗溶液。

在 100mL 離子交換水中，添加 0.7mL 試驗溶液(活性成分濃度 3.5ppm)。此溶液中釋放 20 隻淡色庫蚊(*Culex pipiens pallens*)之終齡幼蟲。8 日後，計算淡色庫蚊存活數目並根據下述公式計算該有害生物死亡率。

有害生物死亡率(%)=(死亡幼蟲數目/試驗幼蟲數目)×100

結果，經本發明化合物(1)至(13)、(15)至(23)、(25)至(32)、(34)、(36)、(38)、(40)至(45)、(47)至(56)及(59)中之任一者處理，有害生物之死亡率顯示為 90%或更多。

試驗例 3

根據調配例 5 獲得本發明某些化合物的調配物。該調配物以水稀釋以製得活性成分為 500ppm 之試驗溶液。

於甘藍(*Brassicae olercea*)之第 3 至第 4 葉期，噴灑 20mL 試驗溶液。試驗溶液乾後，切除上述甘藍之地上部分，並且與 5 隻小菜蛾(*Plutella xylostella*)之第 2 齡幼蟲一起至入聚乙烯杯(容積中：100mL)中。該聚乙烯杯於 25℃ 存放 5 日後，計算小菜蛾之存活或死亡數目並根據下述公式計算該有害生物死亡率。

有害生物死亡率(%)=(死亡幼蟲數目/試驗幼蟲數目)×100

結果，經本發明化合物(1)至(13)、(15)至(23)、(25)、(28)至(32)、(34)、(36)、(38)、(40)、(42)至(44)、(47)至(51)、(53)至(55)、(57)及(61)中之任一者處理，有害生物之死亡率顯示為 80%或更多。

試驗例 4

根據調配例 5 獲得本發明某些化合物的調配物。該調配物以水稀釋以製得活性成分為 500ppm 之試驗溶液。

在直徑 5.5 公分之聚乙烯杯的杯底鋪設直徑 5.5 公分的濾紙。Insecta LF(NOSAN 公司製造)(人工飼料)切為 6mm 厚度，將其對切後置於濾紙上。之後，2mL 試驗溶液倒至該聚乙烯杯中。試驗溶液風乾後，將 5 隻斜紋夜蛾 (*Spodoptera litura*) 第 4 齡幼蟲釋放到該聚乙烯杯內並以蓋子密封。6 日後，計算斜紋夜蛾之存活或死亡數目並根據下述公式計算該有害生物死亡率。

有害生物死亡率(%)=(死亡幼蟲數目/試驗幼蟲數目)×100

結果，經本發明化合物(1)、(5)、(7)至(11)、(15)至(23)、(26)、(28)至(32)、(34)、(36)、(38)、(40)、(42)至(44)、(48)至(51)、(53)及(57)中之任一者處理，有害生物之死亡率顯示為 80%或更多。

試驗例 5

根據調配例 5 獲得本發明某些化合物的調配物。該調配物以水稀釋以製得活性成分為 500ppm 之試驗溶液。

在直徑 5.5 公分之聚乙烯杯的杯底鋪設直徑 5.5 公分的濾紙。Silkmate 2S(NOSAN 公司製造)(人工飼料)切為 2mm 厚度後置於濾紙上。之後，1mL 試驗溶液倒至該聚乙烯杯中。試驗溶液風乾後，直徑 5.5 公分的濾紙置於人工飼料上，將 30 隻紋捲葉蛾 (*Adoxophyes orana*) 第 1 齡幼蟲置於其上。該杯以蓋子密封。7 日後，計算紋捲葉蛾之存活或死亡數目並根據下述公式計算該有害生物死亡率。

有害生物死亡率(%)=(死亡幼蟲數目/試驗幼蟲數目) $\times$ 100

結果，經本發明化合物(1)至(5)、(7)至(13)、(15)至(23)、(25)至(32)、(34)、(36)、(38)、(40)、(42)至(44)、(47)至(59)及(61)中之任一者處理，有害生物之死亡率顯示為90%或更多。

[產業利用性]

本發明化合物對有害生物具有防治效果，因此係適用於作為殺蟲組成物之活性成分。

【圖式簡單說明】

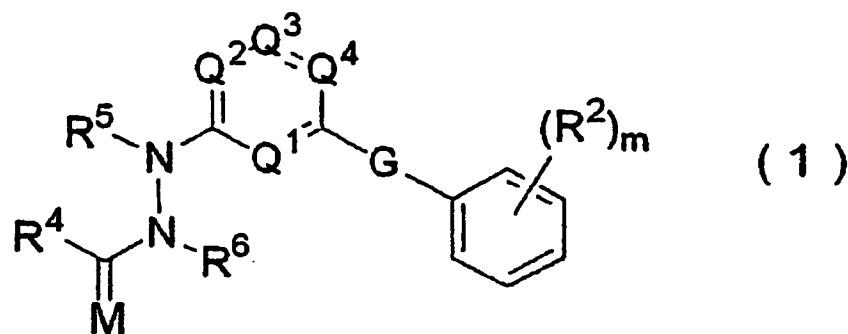
無

【主要元件符號說明】

無

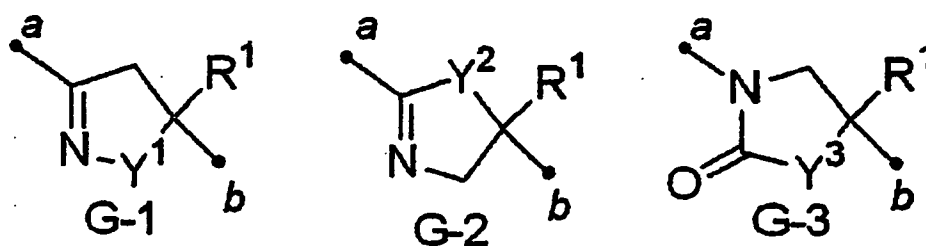
七、申請專利範圍：

1. 一種下式(1)表示之胍化合物：



式中，

G 表示下式 G-1、G-2 或 G-3 所示之 5-員雜環基：



其中， a ●—— 及 b ●—— 各表示鍵且 b ●—— 係連

結至式(1)之 部分，

R¹ 表示 C1-C4 鹵烷基，

Y¹ 表示氧原子、硫原子或 NR⁷ 基，

Y² 表示氧原子、硫原子、NR⁷ 基或亞甲基，

Y³ 表示氧原子、硫原子、NR⁷ 基或亞甲基，

R⁷ 表示 C1-C6 烷基、C2-C6 烯基、C2-C6 炔基、C3-C6 環烷基、C4-C7 環烷基烷基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C2-C6 烷基胺基羰基、C3-C9 二烷基胺基羰基、苯基、氰基、甲醯基或氫原子，

M 表示氧原子或硫原子，

Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 獨立地表示氮原子或 CR^3 基，

R^3 表示視需要經鹵化之 C1-C6 烷基、視需要經鹵化之 C1-C6 烷氧基、硝基、氰基、鹵原子或氫原子，

m 表示 0 至 5 之整數，

R^2 表示視需要經鹵化之 C1-C6 烷基、視需要經鹵化之 C1-C6 烷氧基、C1-C6 烷基硫基、C1-C6 烷基亞磺基、C1-C6 烷基磺基、硝基、氰基或鹵原子，

限制條件為當 m 為 2 至 5 之整數時，該等 R^2 可彼此相同或不同，

R^5 及 R^6 獨立地表示視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基、視需要經選自 E2 群之基團取代之苯甲基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C3-C12 環烷基、甲基或氫原子，

R^4 表示視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基、視需要經選自 E2 群之基團取代之 C3-C12 環狀烴基、具有氧原子、硫原子及/或氮原子且視需要經選自 E2 群之基團取代之 5-至 6-員雜環基、 OR^8 基、 $N(R^9)R^{10}$ 基或氫原子，

R^8 表示視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基、視需要經選自 E2 群之基團取代之 C3-C12 環狀烴基或具有氧原子、硫原子及/或氮原子且視需要經選自 E2 群之基團取代之 5-至 6-員雜環基，

R^9 表示視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈

烴基或視需要經選自 E2 群之基團取代之 C3-C12 環狀烴基，

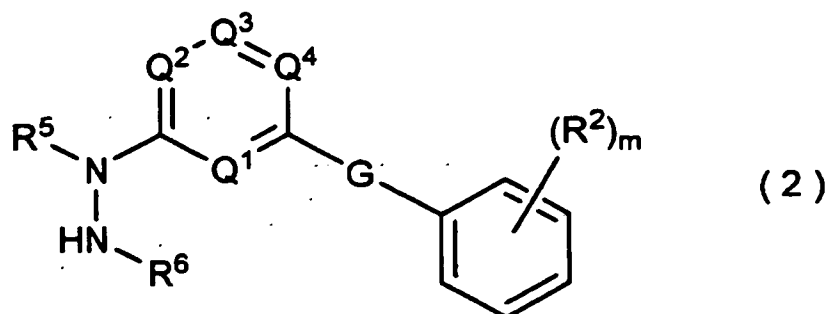
R^{10} 表示視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基或氫原子，或

R^9 及 R^{10} 於其末端結合以表示 C2-C9 烷二基，

E1 群係由視需要經選自 E2 群之基團取代之 C3-C12 環狀烴基、具有氧原子、硫原子及/或氮原子且視需要經選自 E2 群之基團取代之 5-至 6-員雜環基、視需要經選自 E2 群之基團取代之苯氧基、視需要經選自 E2 群之基團取代之苯基胺基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C1-C6 烷氧基、C1-C6 烷基胺基、C2-C12 二烷基胺基、硝基、氰基、甲醯基與鹵原子所成之組群，以及

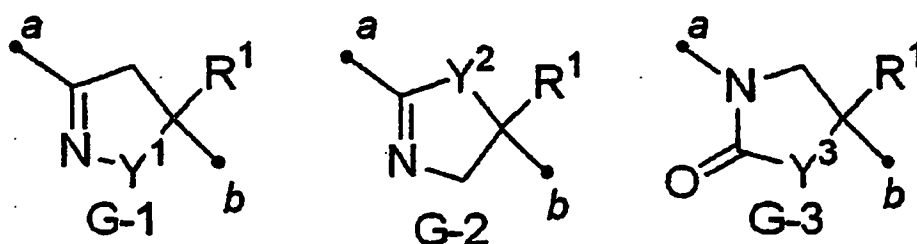
E2 群係由視需要經鹵化之 C1-C6 烷基、視需要經鹵化之 C1-C6 烷氧基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C1-C6 烷基胺基、C2-C12 二烷基胺基、硝基、氰基、甲醯基與鹵原子所成之組群。

2. 一種有害生物防治組成物，包括申請專利範圍第 1 項之胍化合物作為活性成分。
3. 一種有害生物防治方法，其包括對有害生物或該有害生物之棲息地施用有效量之申請專利範圍第 1 項之胍化合物。
4. 一種下式(2)表示之胍化合物：

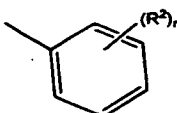


式中，

G 表示下式 G-1、G-2 或 G-3 所示之 5-員雜環基



其中， a ●—— 及 b ●—— 各表示鍵且 b ●—— 係連

結至式(2)之  部分，

R^1 表示 C1-C4 鹵烷基，

Y^1 表示氧原子、硫原子或 NR^7 基，

Y^2 表示氧原子、硫原子、 NR^7 基或亞甲基，

Y^3 表示氧原子、硫原子、 NR^7 基或亞甲基，

R^7 表示 C1-C6 烷基、C2-C6 烯基、C2-C6 炔基、C3-C6 環烷基、C4-C7 環烷基烷基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C2-C6 烷基胺基羰基、C3-C9 二烷基胺基羰基、苯基、氰基、甲醯基或氫原子，

Q^1 、 Q^2 、 Q^3 及 Q^4 獨立地表示氮原子或 CR^3 基，

R^3 表示視需要經鹵化之 C1-C6 烷基、視需要經鹵化

之 C1-C6 烷氧基、硝基、氰基、鹵原子或氫原子，

m 表示 0 至 5 之整數，

R^2 表示視需要經鹵化之 C1-C6 烷基、視需要經鹵化之 C1-C6 烷氧基、C1-C6 烷基硫基、C1-C6 烷基亞磺醯基、C1-C6 烷基磺醯基、硝基、氰基或鹵原子，

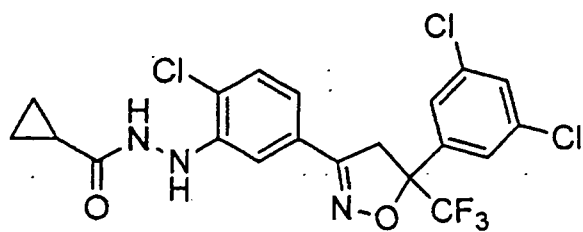
限制條件為當 m 為 2 至 5 之整數時，該等 R^2 可彼此相同或不同，

R^5 及 R^6 獨立地表示視需要經選自 E1 群之基團取代之 C1-C12 鏈烴基、視需要經選自 E2 群之基團取代之苯甲醯基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C3-C12 環烷基、甲醯基或氫原子，

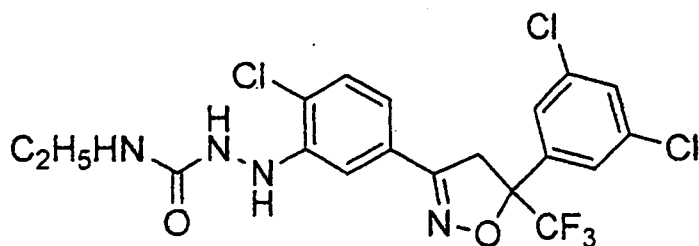
E1 群係由視需要經選自 E2 群之基團取代之 C3-C12 環狀烴基、具有氧原子、硫原子及/或氮原子且視需要經選自 E2 群之基團取代之 5-至 6-員雜環基、視需要經選自 E2 群之基團取代之苯氧基、視需要經選自 E2 群之基團取代之苯基胺基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C1-C6 烷氧基、C1-C6 烷基胺基、C2-C12 二烷基胺基、硝基、氰基、甲醯基與鹵原子所成之組群，以及

E2 群係由視需要經鹵化之 C1-C6 烷基、視需要經鹵化之 C1-C6 烷氧基、C2-C6 烷基羰基、C2-C6 烷氧基羰基、C1-C6 烷基胺基、C2-C12 二烷基胺基、硝基、氰基、甲醯基與鹵原子所成之組群。

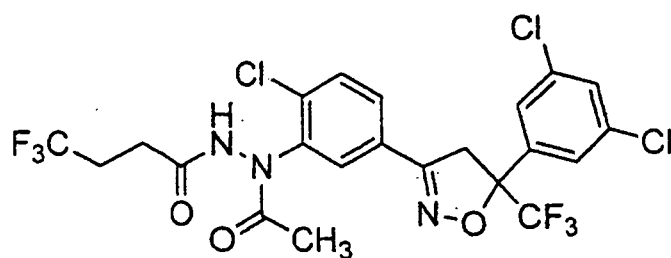
5. 一種下式表示之化合物：



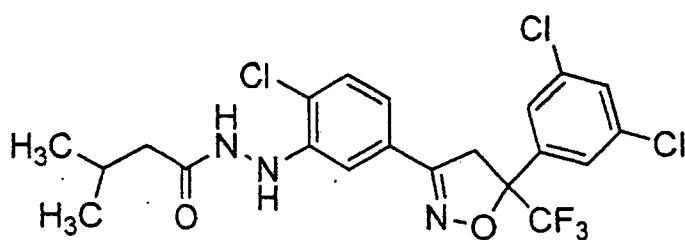
6. 一種下式表示之化合物：



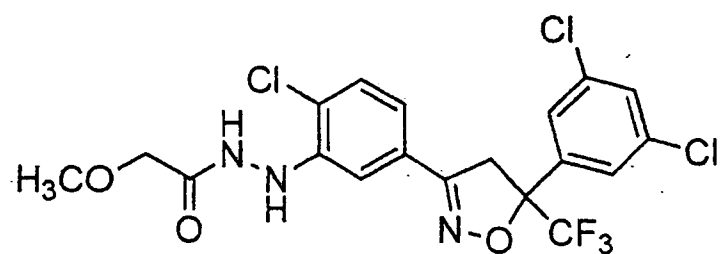
7. 一種下式表示之化合物：



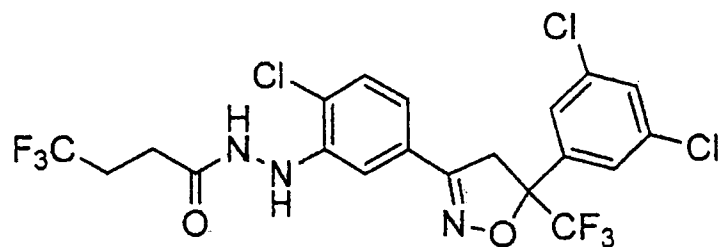
8. 一種下式表示之化合物：



9. 一種下式表示之化合物：



10. 一種下式表示之化合物：



11. 一種下式表示之化合物：

