

發明專利說明書

PD1073192(5)

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：96143142

A01N 43/86 (2006.01),
A01N 41/06 (2006.01),

※申請日期：96.11.15

※IPC 分類：C07D 265/08 (2006.01),
C07D 273/06 (2006.01),

一、發明名稱：(中文/英文)

A01P 13/00 (2006.01)

鹵烷基磺苯胺衍生物或其鹽類、與以此為有效成分之除草劑及其使用方法

HALOALKYL SULFONANILIDE DERIVATIVES OR SALTS THEREOF, HERBICIDE

USING IT AS EFFECTIVE CONSTITUENT AND USE-METHOD THEREOF.

二、申請人：(共1人)

姓名或名稱：(中文/英文)(簽章) ID :

日本農藥股份有限公司(日本農藥株式会社)

NIHON NOHYAKU CO., LTD.

代表人：(中文/英文)(簽章)

大內脩吉

OHUCHI, SHUKICHI

住居所或營業所地址：(中文/英文)

日本國東京都中央區日本橋1丁目2番5號

2-5, Nihonbashi 1-chome, Chuo-ku, Tokyo, Japan

國籍：(中文/英文)

日本

Japan

三、發明人：(共4人)

姓名：(中文/英文) ID：

1. 日野智和/HINO, TOMOKAZU
2. 山田康子/YAMADA, YASUKO
3. 重成俊彦(重成俊彦)/SHIGENARI, TOSHIHIKO
4. 豆塚弘毅(豆塚弘毅)/MAMETSUKA, KOK

國籍：(中文/英文)

- 1.~4. 日本
Japan

四、聲明事項：

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

申請前已向下列國家(地區)申請專利：

【格式請依：受理國家(地區)、申請日、申請案號 順序註記】

有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

日本 2006/11/17 特願 2006-312140

無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

主張專利法第三十條生物材料：

須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

三、發明人：(共 4 人)

姓 名：(中文/英文) ID：

1. 日野智和/HINO, TOMOKAZU
2. 山田康子/YAMADA, YASUKO
3. 重成俊彥(重成俊彦)/SHIGENARI, TOSHIHIKO
4. 豆塚弘毅(豆塚弘毅)/MAMETSUKA, KOK

國 籍：(中文/英文)

- 1.~4. 日本
Japan

四、聲明事項：

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

申請前已向下列國家(地區)申請專利：

【格式請依：受理國家(地區)、申請日、申請案號 順序註記】

有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

日本 2006/11/17 特願 2006-312140

無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

主張專利法第三十條生物材料：

須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係相關於新穎的鹵烷基砒苯胺衍生物或其鹽類，與以此為有效成分之除草劑及其使用方法。

【先前技術】

先前，鹵烷基砒苯胺衍生物和雜環乃隔著伸烷基等間隔物質，與雜環內氮原子鍵結的架構之化合物係有助於作為除草劑（參考專利文獻 1 或 2）。惟，對於本發明的鍵結於 6 員環或 7 員環之鹵烷基砒苯胺衍生物及其除草活性不甚明瞭。

【專利文獻 1】特開 2004-107322 號公報

【專利文獻 2】特開 2006-265240 號公報

【發明內容】

【解決發明之課題】

如上述般，某種鹵烷基砒苯胺衍生物係有助於作為除草劑，惟其除草效果、對含難以根除之雜草的多種雜草種之廣泛適用性、效果之持續性、優異的作物-雜草間之選擇性等特性尚不足，需研發出具備更優異特性之除草劑組成物。因此，本發明的目的係提供一種兼具顯著的除草效果和優異的作物-雜草間選擇性等特性之除草劑。

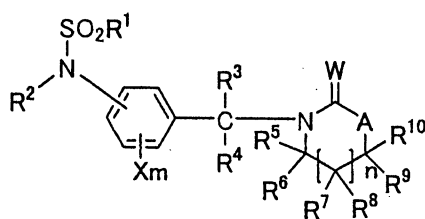
【解決課題之方法】

本發明人等致力研究開發一種新穎的除草劑即含砒苯胺結構的衍生物之合成和其生理活性，結果發現本發明的通式 (I) 所示的新穎鹵烷基砒苯胺衍生物，係兼具顯著的

除草效果、對含難以根除之雜草的多種雜草種之廣泛適用性、效果之持續性及優異的作物-雜草間選擇性等特性之除草劑，特別有益於作為水田用除草劑而完成本發明。

亦即，本發明係相關於通式（I）所示的鹵烷基磺苯胺衍生物或其鹽類，與含有此為有效成分之除草劑及其使用方法，

通式 I



{式中， R^1 係表示為鹵（ C_1-C_8 ）烷基， R^2 係氫原子；（ C_1-C_6 ）烷氧基羰基（ C_1-C_6 ）烷基；（ C_1-C_{18} ）烷羰基；鹵（ C_1-C_6 ）烷羰基；苯羰基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y（Y 係如後述）的取代基之取代苯羰基；（ C_1-C_{18} ）烷氧基羰基；（ C_2-C_{18} ）烯氧基羰基；（ C_2-C_{18} ）炔氧基羰基；鹵（ C_1-C_6 ）烷氧基羰基；（ C_1-C_6 ）烷氧基（ C_1-C_6 ）烷氧基羰基；（ C_1-C_6 ）烷基硫（ C_1-C_6 ）烷氧基羰基；（ C_1-C_6 ）烷基亞磺醯（ C_1-C_6 ）烷氧基羰基；（ C_1-C_6 ）烷基磺醯（ C_1-C_6 ）烷氧基羰基；苯氧基羰基、含 1~5 個選自可相同或相異的 Y（Y 係如後述）的取代基之取代苯氧基羰基、苯氧基（ C_1-C_6 ）烷基羰基；含 1~5 個選自 Y（Y 係如後述）的取代基之取代苯氧基（ C_1-C_6 ）烷基羰基；苄氧基羰基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y（Y 係如後述）的取代基之取代苄氧基羰基；（ C_1-C_6 ）烷基硫羰基；（ C_1-C_6 ）烷基磺醯基；鹵（ C_1-C_6 ）

烷基磺醯基；苯基磺醯基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代苯基磺醯基；(C₁-C₆) 烷基；(C₂-C₆) 烯基；(C₂-C₆) 炔基；苯基 (C₁-C₆) 烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯基 (C₁-C₆) 烷基；苯基羰基 (C₁-C₆) 烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯基羰基 (C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₈) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基；可相同或相異的三 (C₁-C₆) 烷基矽烷基 (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基；苯基 (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯基 (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基；苯基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基；苯基羰基氧 (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯基羰基氧 (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷氧基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基；單 (C₁-C₆) 烷胺基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基；可相同或相異的可以相互鍵結而形成 5~8 員環之二 (C₁-C₆) 烷胺基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基；苯胺基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯胺基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基；N-(C₁-C₆) 烷基-N-苯胺基羰基氧 (C₁-C₆)

烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代 N-(C₁-C₆) 烷基-N-苯胺基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基；苯基硫 (C₁-C₆) 烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯基硫 (C₁-C₆) 烷基；苯基磺醯 (C₁-C₆) 烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯基磺醯 (C₁-C₆) 烷基；苯基 (C₁-C₆) 烷基硫 (C₁-C₆) 烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯基 (C₁-C₆) 烷基硫 (C₁-C₆) 烷基；苯基 (C₁-C₆) 烷基磺醯 (C₁-C₆) 烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯基 (C₁-C₆) 烷基磺醯 (C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷基硫 (C₁-C₆) 烷基；鹵 (C₁-C₆) 烷基硫 (C₁-C₆) 烷基；硫氰基 (C₁-C₆) 烷基；雜環 (C₁-C₆) 烷基 (雜環係表示為吡啶、吡啶-N-氧化物、嘍啶、吡嗪、三嗪、咪喃、四氫咪喃、噻吩、四氫噻吩、四氫吡喃、四氫噻吡喃、噁唑、異噁唑、噁二唑、噻唑、異噻唑、噻二唑、咪唑、三唑、吡唑、吡咯、吡咯烷、酞醯亞胺或 2,3-二氫-1,2-苯并噻唑-3-酮 = 1,1-二氧化物)；或於環上含 1~4 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代雜環 (C₁-C₆) 烷基 (雜環係與上述相同)，

R³ 及 R⁴ 係表示可相同或相異的氫原子；(C₁-C₆) 烷基；(C₃-C₆) 環烷基；(C₁-C₆) 烷氧基；鹵原子；或氰基，又 R³ 和 R⁴ 係可相互鍵結形成 3~7 員環，

R^5 及 R^6 係表示可相同或相異的氫原子；(C₁-C₆) 烷基；
(C₃-C₆) 環烷基；(C₁-C₆) 烷氧基；鹵原子；或氰基，

R^7 、 R^8 、 R^9 及 R^{10} 係可相同或相異的氫原子；鹵原子；
(C₁-C₆) 烷基；(C₃-C₆) 環烷基；(C₁-C₆) 烷氧基；鹵(C₁-C₆)
烷基；(C₁-C₆) 烷氧基(C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷基羰基
氧(C₁-C₆) 烷基；單(C₁-C₆) 烷基胺基(C₁-C₆) 烷基；可
相同或相異的二(C₁-C₆) 烷基胺基(C₁-C₆) 烷基；單(C₁-C₆)
烷基胺基羰基(C₁-C₆) 烷基；可相同或相異的二(C₁-C₆) 烷基
胺基羰基(C₁-C₆) 烷基；苯基(C₁-C₆) 烷基；於環上含 1~5
個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代
苯基(C₁-C₆) 烷基；苯氧基(C₁-C₆) 烷基；於環上含 1~5
個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代
苯氧基(C₁-C₆) 烷基；苯基；含 1~5 個選自可相同或相異
的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代苯基；(C₁-C₆) 烷氧
基羰基；單(C₁-C₆) 烷基胺基羰基；可相同或相異的二(C₁-C₆)
烷基胺基羰基；羥基；或氰基，又 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 及 R^{10}
係可與相鄰的取代基相互鍵結，藉由可以由選自可相同或
相異的氧原子；硫原子；或氮原子(該氮原子係可被氫原
子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基或環(C₃-C₆)
烷基取代) 中的 1 或 2 個雜原子中斷之(C₁-C₄) 伸烷基形
成 3 至 7 員環，

n 係 1 或 2，

A 係氧原子或硫原子，

W 係氧原子或硫原子，

X 係表示可為相同或相異的鹵原子；(C₁-C₆) 烷基；(C₂-C₆) 烯基；(C₂-C₆) 炔基；環(C₃-C₆) 烷基；鹵(C₁-C₆) 烷基；環鹵(C₃-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷氧基；鹵(C₁-C₆) 烷氧基；(C₁-C₆) 烷氧基(C₁-C₆) 烷基；鹵(C₁-C₆) 烷氧基(C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷硫基；鹵(C₁-C₆) 烷硫基；(C₁-C₆) 烷硫基(C₁-C₆) 烷基；鹵(C₁-C₆) 烷硫基(C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基；鹵(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基；(C₁-C₆) 烷基磺醯基；鹵(C₁-C₆) 烷基磺醯基；苯基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代苯基；苯氧基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代苯氧基；苯硫基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代苯硫基；苯亞磺醯基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代苯亞磺醯基；苯磺醯基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代苯磺醯基；(C₁-C₆) 烷基羰基；鹵(C₁-C₆) 烷基羰基；苯羰基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代苯羰基；(C₁-C₆) 烷氧基羰基；羧基；單(C₁-C₆) 烷胺基羰基；可相同或相異的二(C₁-C₆) 烷胺基羰基；苯胺基羰基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代苯胺基羰基；苯基(C₁-C₆) 烷胺基羰基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如

後述)之取代基之取代苯基(C₁-C₆)烷胺基羰基；羥基或
 氰基，m係0至4之整數，又X係可與苯環上相鄰的碳原
 子在一起，藉由可以由選自可相同或相異的氧原子；硫原
 子；或氮原子(該氮原子係可被氫原子、(C₁-C₆)烷基、
 (C₂-C₆)烯基、(C₂-C₆)炔基或環(C₃-C₆)烷基取代)中
 的1或2個雜原子中斷之(C₁-C₄)伸烷基形成5或6員環，

Y係選自可相同或相異的鹵原子；硝基；(C₁-C₆)烷
 基；(C₂-C₆)烯基；(C₂-C₆)炔基；環(C₃-C₆)烷基；鹵
 (C₁-C₆)烷基；環鹵(C₃-C₆)烷基；(C₁-C₆)烷氧基；鹵
 (C₁-C₆)烷氧基；氰基(C₁-C₆)烷氧基；(C₁-C₆)烷氧基
 (C₁-C₆)烷氧基；(C₁-C₆)烷硫基；鹵(C₁-C₆)烷硫基；
 (C₁-C₆)烷基亞磺醯基；鹵(C₁-C₆)烷基亞磺醯基；(C₁-C₆)
 烷基磺醯基；鹵(C₁-C₆)烷基磺醯基；苯基；具有1~5個
 選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆)烷基、(C₂-C₆)烯
 基、(C₂-C₆)炔基、環(C₃-C₆)烷基、鹵(C₁-C₆)烷基、
 環鹵(C₃-C₆)烷基、(C₁-C₆)烷氧基、鹵(C₁-C₆)烷氧基、
 (C₁-C₆)烷硫基、鹵(C₁-C₆)烷硫基、(C₁-C₆)烷基亞磺
 醯基、鹵(C₁-C₆)烷基亞磺醯基、(C₁-C₆)烷基磺醯基、
 鹵(C₁-C₆)烷基磺醯基、(C₁-C₆)烷羰基、鹵(C₁-C₆)烷
 羰基、(C₁-C₆)烷氧羰基、羧基、單(C₁-C₆)烷胺基羰基、
 可相同或相異的二(C₁-C₆)烷胺基羰基、羥基或氰基的取
 代基之取代苯基；雜環基(雜環基係表示為吡啶基、吡啶
 -N-氧化物基、嘓啶基、吡咩基、三咩基、呋喃基、四氫呋

喃基、噻吩基、四氫噻吩基、四氫吡喃基、四氫噻吡喃基、噁唑基、異噁唑基、噁二唑基、噻唑基、異噻唑基、噻二唑基、咪唑基、三唑基、吡唑基、吡咯基、吡咯烷基)；於環上含 1 個以上選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、環(C₃-C₆) 烷基、鹵(C₁-C₆) 烷基、環鹵(C₃-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、鹵(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、鹵(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、(C₁-C₆) 烷基磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基磺醯基、(C₁-C₆) 烷羰基、鹵(C₁-C₆) 烷羰基、(C₁-C₆) 烷氧羰基、羧基、單(C₁-C₆) 烷胺基羰基、相同或相異的二(C₁-C₆) 烷胺基羰基、羥基或氰基的取代基之取代雜環基(雜環基係與上述相同)；苯氧基；含 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、環(C₃-C₆) 烷基、鹵(C₁-C₆) 烷基、環鹵(C₃-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、鹵(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、鹵(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、(C₁-C₆) 烷基磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基磺醯基、(C₁-C₆) 烷羰基、鹵(C₁-C₆) 烷羰基、(C₁-C₆) 烷氧羰基、羧基、單(C₁-C₆) 烷胺基羰基、可相同或相異的二(C₁-C₆) 烷胺基羰基、羥基或氰基的取代基之取代苯氧基；苯硫基；含 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、環(C₃-C₆) 烷基、鹵(C₁-C₆) 烷基、環鹵

(C₃-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、鹵(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、鹵(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、(C₁-C₆) 烷基磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基磺醯基、(C₁-C₆) 烷羰基、鹵(C₁-C₆) 烷羰基、(C₁-C₆) 烷氧羰基、羧基、單(C₁-C₆) 烷胺基羰基、可相同或相異的二(C₁-C₆) 烷胺基羰基、羥基或氰基的取代基之取代苯硫基；苯基亞磺醯基；含 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、環(C₃-C₆) 烷基、鹵(C₁-C₆) 烷基、環鹵(C₃-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、鹵(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、鹵(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、(C₁-C₆) 烷基磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基磺醯基、(C₁-C₆) 烷羰基、鹵(C₁-C₆) 烷羰基、(C₁-C₆) 烷氧羰基、羧基、單(C₁-C₆) 烷胺基羰基、可相同或相異的二(C₁-C₆) 烷胺基羰基、羥基或氰基的取代基之取代苯基亞磺醯基；苯基磺醯基；含 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、環(C₃-C₆) 烷基、鹵(C₁-C₆) 烷基、環鹵(C₃-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、鹵(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、鹵(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、(C₁-C₆) 烷基磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基磺醯基、(C₁-C₆) 烷羰基、鹵(C₁-C₆) 烷羰基、(C₁-C₆) 烷氧羰基、羧基、單(C₁-C₆) 烷胺基羰基、可相同或相異的二(C₁-C₆) 烷胺基羰基、羥

基或氰基的取代基之取代苯基磺醯基；(C₁-C₆) 烷羰基；
鹵(C₁-C₆) 烷羰基；苯基羰基；含 1~5 個選自可相同或相
異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔
基、環(C₃-C₆) 烷基、鹵(C₁-C₆) 烷基、環鹵(C₃-C₆) 烷
基、(C₁-C₆) 烷氧基、鹵(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫
基、鹵(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、鹵(C₁-C₆)
烷基亞磺醯基、(C₁-C₆) 烷基磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基磺
醯基、(C₁-C₆) 烷羰基、鹵(C₁-C₆) 烷羰基、(C₁-C₆) 烷
氧羰基、羧基、單(C₁-C₆) 烷胺基羰基、可相同或相異的
二(C₁-C₆) 烷胺基羰基、羥基或氰基的取代基之取代苯基
羰基；(C₁-C₆) 烷氧羰基；羧基；單(C₁-C₆) 烷胺基羰基；
可相同或相異的二(C₁-C₆) 烷胺基羰基；苯胺基羰基；於
環上含 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、
(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、環(C₃-C₆) 烷基、鹵(C₁-C₆)
烷基、環鹵(C₃-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、鹵(C₁-C₆)
烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、鹵(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆)
烷基亞磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、(C₁-C₆) 烷基
磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基磺醯基、(C₁-C₆) 烷羰基、鹵(C₁-C₆)
烷羰基、(C₁-C₆) 烷氧羰基、羧基、單(C₁-C₆) 烷胺基羰
基、可相同或相異的二(C₁-C₆) 烷胺基羰基、羥基或氰基
的取代基之取代苯胺基羰基；苯基(C₁-C₆) 烷胺基羰基；
於環上含 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷
基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、環(C₃-C₆) 烷基、鹵

(C₁-C₆) 烷基、環鹵 (C₃-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、鹵 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、鹵 (C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、鹵 (C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、(C₁-C₆) 烷基磺醯基、鹵 (C₁-C₆) 烷基磺醯基、(C₁-C₆) 烷羰基、鹵 (C₁-C₆) 烷羰基、(C₁-C₆) 烷氧羰基、羧基、單 (C₁-C₆) 烷胺基羰基、可相同或相異的二 (C₁-C₆) 烷胺基羰基、羥基或氰基的取代基之取代苯基 (C₁-C₆) 烷胺基羰基；羥基或氰基中的 1~5 個取代基，又 Y 係可與苯環或雜環上相鄰的碳原子或氮原子在一起，藉由可以由選自可相同或相異的氧原子；硫原子；或氮原子（該氮原子係可被氫原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基或環 (C₃-C₆) 烷基取代）中的 1 或 2 個雜原子中斷之 (C₁-C₄) 伸烷基形成 5 或 6 員環}。

【發明效果】

本發明係提供對含難以根除之雜草的多種雜草種之廣泛適用性、效果之持續性、優異的作物-雜草間的選擇性等特性優異，且特別有益於作為水田用除草劑之鹵烷基磺酸苯胺衍生物。

【實施方式】

本發明的鹵烷基磺酸苯胺衍生物的通式 (I) 之定義中，「鹵原子」係例如氟原子、溴原子、碘原子或氯原子。「(C₁-C₄) 伸烷基」係例如亞甲基、伸乙基、伸丙基、二甲基亞甲基、四亞甲基、異伸丁基、二甲基伸乙基、六亞

甲基等直鏈或分枝鏈狀的碳原子數 1~6 個之伸烷基等，「(C₁-C₆) 烷基」係例如甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、第二丁基、第三丁基、正戊基、新戊基、正己基等直鏈或分枝鏈狀的碳原子數 1~6 個之烷基等。「鹵(C₁-C₆) 烷基」係例如可以相同或相異的 1 個以上的鹵原子取代之直鏈或分枝鏈狀的碳原子數 1~6 個之烷基，例如三氟甲基、二氟甲基、全氟乙基、全氟異丙基、氯甲基、溴甲基、1-溴乙基或 2,3-二溴丙基等。「(C₃-C₆) 環烷基」係例如以環丙基、環丁基、環戊基、環己基、2-甲基環丙基、2-甲基環戊基等碳原子數 3~6 個的脂環族烷基或烷基取代之脂環族烷基等。

「(C₁-C₆) 烷氧基」係例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、第二丁氧基、第三丁氧基、正戊氧基、異戊氧基、新戊氧基、正己氧基等直鏈或分枝鏈狀的碳原子數 1~6 個之烷氧基等。「鹵(C₁-C₆) 烷氧基」係例如可以相同或相異的 1 個以上的鹵原子取代之直鏈或分枝鏈狀的碳原子數 1~6 個之烷氧基，例如二氟甲氧基、三氟甲氧基或 2,2,2-三氟乙氧基等。「(C₁-C₆) 烷氧羰基」係例如甲氧羰基、乙氧羰基、正丙氧羰基、異丙氧羰基、正丁氧羰基、第三丁氧羰基等直鏈或分枝鏈狀的碳原子數 1~6 個之烷氧羰基等。「(C₁-C₆) 烷硫基」係例如甲硫基、乙硫基、正丙硫基、異丙硫基、正丁硫基、第二丁硫基、第三丁硫基、正戊硫基、異戊硫基、正己硫基等直鏈或分

枝鏈狀的碳原子數 1~6 個之烷基等。「(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基」係例如甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、正丙基亞磺醯基、異丙基亞磺醯基、正丁基亞磺醯基、第二丁基亞磺醯基、第三丁基亞磺醯基、正戊基亞磺醯基、異戊基亞磺醯基、正己基亞磺醯基等直鏈或分枝鏈狀的碳原子數 1~6 個之烷基亞磺醯基等。「(C₁-C₆) 烷基磺醯基」係例如甲基磺醯基、乙基磺醯基、正丙基磺醯基、異丙基磺醯基、正丁基磺醯基、第二丁基磺醯基、第三丁基磺醯基、正戊基磺醯基、異戊基磺醯基、正己基磺醯基等直鏈或分枝鏈狀的碳原子數 1~6 個之烷基磺醯基等。「雜環 (C₁-C₆) 烷基」係例如直鏈或分枝鏈狀的碳原子數 1~6 個的烷基鍵結於雜環上之基。

「雜環」係例如吡啶、吡啶-N-氧化物、嘧啶、吡嘞、三嘞、咪喃、四氫咪喃、噻吩、四氫噻吩、四氫吡喃、四氫噻吡喃、噁唑、異噁唑、噁二唑、噻唑、異噻唑、噻二唑、咪唑、三唑、吡唑、吡咯、吡咯烷、酞醯亞胺或 2,3-二氫-1,2-苯并噻唑-3-酮 = 1,1-二氧化物等。「雜環基」係例如吡啶基、吡啶-N-氧化物基、嘧啶基、吡嘞基、三嘞基、咪喃基、四氫咪喃基、噻吩基、四氫噻吩基、四氫吡喃基、四氫噻吡喃基、噁唑基、異噁唑基、噁二唑基、噻唑基、異噻唑基、噻二唑基、咪唑基、三唑基、吡唑基、吡咯基、吡咯烷基等。

「(C₂-C₆) 烯基」係例如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯

基、異丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、3-甲基-1-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、3-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、2-甲基-2-丁烯基、1-己烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基等直鏈或分枝鏈狀的碳原子數 1~6 個之烯基等。「(C₂-C₁₈) 烯基」係除了上述 (C₂-C₆) 烯基之外，尚有例如 1-庚烯基、1-辛烯基、1-壬烯基、1-癸烯基、十七碳烯基或十八碳烯基等。

「(C₂-C₆) 炔基」係例如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、3-甲基-1-丙炔基、2-甲基-3-丙炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基等碳數 1~6 的直鏈或分枝鏈狀的炔基等。「(C₂-C₁₈) 炔基」係除了上述 (C₂-C₆) 炔基之外，尚有例如 1-庚炔基、1-辛炔基、1-壬炔基、1-癸炔基、十七碳炔基或十八碳炔基等。

又，「(C₁-C₆)」、「(C₃-C₆)」、「(C₁-C₁₈)」等係表示各種取代基的碳原子數之範圍。鍵結上述取代基之基亦可以表示為上述定義，例如「(C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基」係表示直鏈或分枝鏈狀的碳數 1~6 個之烷氧基鍵結於直鏈或分枝鏈狀的碳數 1~6 個之烷基。

本發明的通式 (I) 表示的鹵烷基砒苯胺衍生物之鹽類，係例如鈉離子、鉀離子等鹼金屬鹽、鈣離子等鹼土類金屬鹽等。又鹽類亦可為水合物。

本發明的通式 (I) 表示的鹵烷基砒苯胺衍生物，其結

構式中含有 1 個或複數個不對稱中心時，有時亦存在 2 種以上的光學異構物及非立體異構物，惟本發明包括各種光學異構物及這些以任一比例含有之混合物。

本發明的通式 (I) 表示的鹵烷基砒苯胺衍生物中， R^1 係宜為氟 (C_1-C_8) 烷基，尤宜三氟甲基。

R^2 係宜為氫原子；(C_1-C_6) 烷基；(C_1-C_6) 烷氧基羰基 (C_1-C_6) 烷基；(C_1-C_{18}) 烷羰基；鹵 (C_1-C_6) 烷羰基；(C_1-C_{18}) 烷氧羰基；鹵 (C_1-C_6) 烷氧羰基；(C_1-C_8) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷基；(C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷基；(C_1-C_6) 烷基羰氧基 (C_1-C_6) 烷基；或 (C_1-C_6) 烷氧基羰氧基 (C_1-C_6) 烷基，尤宜氫原子；(C_1-C_6) 烷基；(C_1-C_{18}) 烷氧羰基；鹵 (C_1-C_6) 烷氧羰基；(C_1-C_8) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷基；或 (C_1-C_6) 烷基羰氧基 (C_1-C_6) 烷基。

R^3 、 R^4 、 R^5 及 R^6 係尤宜氫原子。

R^7 及 R^8 係可相同或相異的氫原子；鹵原子；(C_1-C_6) 烷基；(C_3-C_6) 環烷基；(C_1-C_6) 烷氧基；鹵 (C_1-C_6) 烷基；或 (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷基，尤宜氫原子；或 (C_1-C_6) 烷基。

R^9 及 R^{10} 係宜為可相同或相異的氫原子；鹵原子；(C_1-C_6) 烷基；(C_3-C_6) 環烷基；(C_1-C_6) 烷氧基；鹵 (C_1-C_6) 烷基；(C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷基；苯基 (C_1-C_6) 烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、(C_1-C_6) 烷基、鹵 (C_1-C_6) 烷基、(C_1-C_6) 烷氧基或鹵 (C_1-C_6) 烷氧

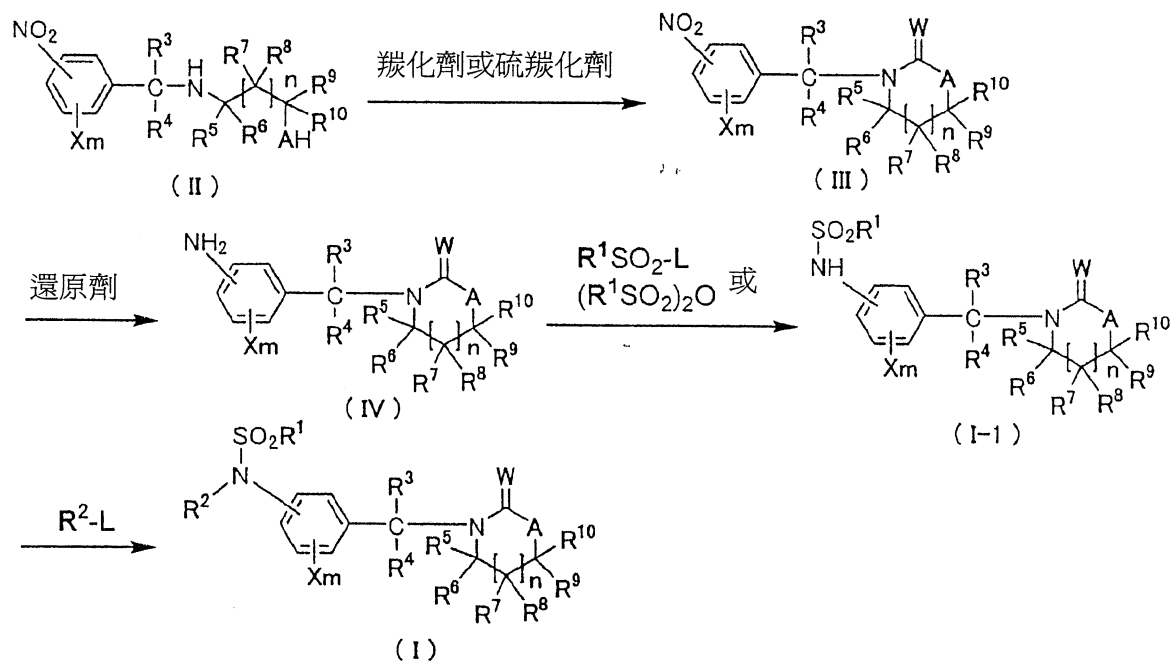
基的取代基之取代苯基 (C₁-C₆) 烷基；苯基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、鹵 (C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基或鹵 (C₁-C₆) 烷氧基的取代基之取代苯基，尤宜氫原子；(C₁-C₆) 烷基；(C₃-C₆) 環烷基；鹵 (C₁-C₆) 烷基；苯基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基或 (C₁-C₆) 烷氧基的取代基之取代苯基。又，R⁷、R⁸、R⁹ 及 R¹⁰ 係宜為可與相鄰的取代基相互鍵結，藉由可以由選自可相同或相異的氧原子；硫原子；或氮原子（該氮原子係可被氫原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基或環 (C₃-C₆) 烷基取代）中的 1 或 2 個雜原子中斷之 (C₁-C₄) 伸烷基形成 3 至 7 員環之形態，尤宜為 R⁷、R⁸、R⁹ 及 R¹⁰ 係可與相鄰的取代基相互鍵結，藉由 (C₁-C₄) 伸烷基形成 3 至 7 員環。

m 尤宜為 0（表示 X 係無取代）。n 尤宜為 1。A 及 W 尤宜為氧原子。

以下，以圖示法顯示本發明的鹵烷基砒苯胺衍生物之代表性製造方法，惟本發明不受限於此。

製造方法 1

本發明的通式 (I) 表示之鹵烷基砒苯胺衍生物，係可以下述製造方法進行製造。



(式中， R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、 A 、 X 、 W 、 m 及 n 係與上述相同， L 係表示為鹵原子等脫離基。)

藉由使通式 (II) 表示的硝化合物在鹼及惰性溶劑的存在下或不存在下，與光氣等羰化劑或硫光氣等硫羰化劑反應，作為通式 (III) 表示的環狀硝化合物，單離 (isolate) 或不單離該化合物，藉由還原該硝基而作為通式 (IV) 表示的苯胺類，單離或不單離該苯胺類，藉由使 $\text{R}^1\text{SO}_2\text{-L}$ 或 $(\text{R}^1\text{SO}_2)_2\text{O}$ 表示的鹵烷基磺苯胺衍生物反應，可製造部分的本發明化合物通式 (I-1) 表示的鹵烷基磺苯胺衍生物 (通式 (I) 中的 R^2 係氫原子時)。單離或不單離通式 (I-1) 表示的鹵烷基磺苯胺衍生物，藉由使 $\text{R}^2\text{-L}$ 表示的化合物反應，可製造本發明的通式 (I) 表示之鹵烷基磺苯胺衍生物。

1-1) 通式 (II) \rightarrow 通式 (III)

可使用於本反應的惰性溶劑係不會明顯地抑制本反應

進行者即可，例如二乙醚、四氫呋喃、二噁烷等鏈狀或環狀醚類、苯、甲苯、二甲苯等芳香族烴類、二氯甲烷、三氯甲烷、四氯化碳等鹵化烴類、氯苯、二氯苯等鹵化芳香烴類等惰性溶劑，這些惰性溶劑係可單獨使用或混合 2 種以上而使用。可使用於本反應的羰化劑例如光氣、二光氣、三光氣、二碳酸乙酯、1,1'-羰二咪唑等。硫羰化劑例如硫光氣、1,1'-硫羰二咪唑等。羰化劑或硫羰化劑之用量，係可適當地選自相對於通式 (II) 表示的硝化合物，約 0.3~10 倍莫耳之範圍。可使用於本反應的鹼，例如三乙胺、二異丙基乙胺、1,8-二雜氮二環 [5.4.0]-7-十一烯、吡啶等含氮有機鹼類、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鈉、氫氧化鈉、氫氧化鉀、氫化鈉、金屬鈉等無機鹼類、醋酸鈉、醋酸鉀等有機鹼類、乙醇鈉、第三丁醇鉀等醇鹽類等。鹼之用量，係可適當地選自相對於通式 (II) 表示的硝化合物，約 0.5~5 倍莫耳之範圍。反應溫度係選自約 0~150°C 之範圍，反應時間係依據反應規模、反應溫度等而異，惟適當地選自數分鐘至約 48 小時之範圍。反應結束後，依據常法自含有目的物的反應系單離出目的物，可依需求藉由再結晶法、蒸餾法、管柱層析法等進行精製而製造目的物。又本反應結束後，亦可不單離目的物而供予其次之反應。

1-2) 通式 (III) \rightarrow 通式 (IV)

可使用於本反應的惰性溶劑，例如甲醇、乙醇等醇類、四氫呋喃、二噁烷等醚類、水等，這些惰性溶劑係可單獨

使用或混合 2 種以上而使用。亦可直接使用其次所示的作為還原劑使用之酸水溶液。可使用於本反應的還原劑，係例如金屬-酸、金屬-鹼等，金屬係例如鐵、錫、鋅等，酸係例如鹽酸、硫酸等礦酸類、醋酸等有機酸類等，鹼係例如氯化錫、氯化銨等。亦可組合這些而使用。還原劑之用量，係可適當地選自相對於通式 (III) 表示的環狀硝化合物，金屬約 1~10 倍莫耳，酸及鹼約 0.05~10 倍莫耳之範圍。反應溫度係選自約 0~150°C 之範圍，反應時間係依據反應規模、反應溫度等而異，適當地選自數分鐘至約 48 小時之範圍即可。又，還原反應係可於催化劑的存在下，依據接觸氫添加法而進行，催化劑係例如鈀碳等。反應結束後，依據常法自含有目的物的反應系單離出目的物，可依需求藉由再結晶法、蒸餾法、管柱層析法等進行精製而製造目的物。又本反應結束後，亦可不單離目的物而供予其次之反應。

1-3) 通式 (IV) \rightarrow 通式 (I-1)

可使用於本反應的惰性溶劑，係不會明顯地抑制本反應進行者即可，例如二乙醚、四氫呋喃、二噁烷等鏈狀或環狀醚類、苯、甲苯、二甲苯等芳香族烴類、二氯甲烷、三氯甲烷、四氯化碳等鹵化烴類、氯苯、二氯苯等鹵化芳香族烴類、乙腈等腈類、醋酸乙酯等酯類、N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺等醯胺類、二甲基亞砷、1,3-二甲基-2-咪唑二酮、水等惰性溶劑，這些惰性溶劑係可單獨使

用或混合 2 種以上而使用。可使用於本反應的鹼，例如三乙胺、二異丙基乙胺、1,8-二雜氮二環 [5.4.0]-7-十一烯、吡啶等含氮有機鹼類、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鈉、氫氧化鈉、氫氧化鉀、氫化鈉、金屬鈉等無機鹼類、醋酸鈉、醋酸鉀等有機鹼類、乙醇鈉、第三丁醇鉀等醇鹽類等。鹼之用量，係可適當地選自相對於通式 (IV) 表示的苯胺類，約 0.5~5 倍莫耳之範圍。本反應中為要促進反應，亦可使用相轉換催化劑。可使用的相轉換催化劑，例如正溴化四丁銨、苄溴化三乙銨等 4 級銨鹽、18-冠-6 等環狀醚類等。因本反應係等莫耳反應，等莫耳使用各反應劑即可，惟亦可過剩地使用任一反應劑。反應溫度係約 -20°C 至使用的惰性溶劑的回流溫度之範圍內，反應時間係依據反應規模、反應溫度等而異，適當地選自數分鐘至約 48 小時之範圍即可。反應結束後，依據常法自含有目的物的反應系分離出目的物，可依需求藉由再結晶法、蒸餾法、管柱層析法等進行精製而製造目的物。又本反應結束後，亦可不分離目的物而供予其次之反應。

1-4) 通式 (I-1) \rightarrow 通式 (I)

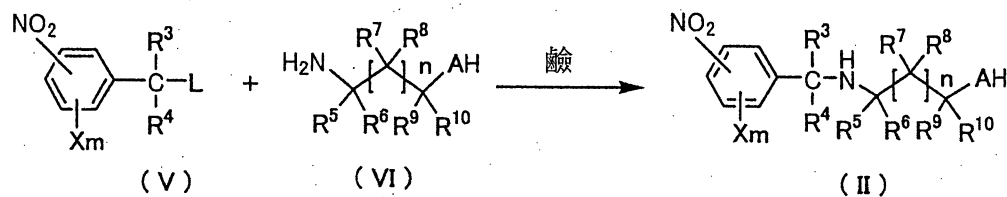
本反應係依據 1-3) 實施即可。

反應結束後，依據常法自含有目的物的反應系分離出目的物，可依需求藉由再結晶法、蒸餾法、管柱層析法等進行精製而製造目的物。

通式 (II) 表示的起始物質係可依據既知的文獻 {例如

Tetrahedron Lett., 31, 4661 (1990)、Synth. Commun., 24 (10), 1415 (1994)、Bull. Soc. Chim. Fr., 10, 347 (1943) 等}記載之方法而製造，以下顯示中間體之製造方法。

中間體製造方法 1



(式中， R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、L、A、X、W、m 及 n 係與上述相同。)

使通式 (V) 表示的硝基苯類和通式 (VI) 表示的胺類在鹼及惰性溶劑的存在下或不存在下進行反應，藉此可製造通式 (II) 表示的硝化合物。

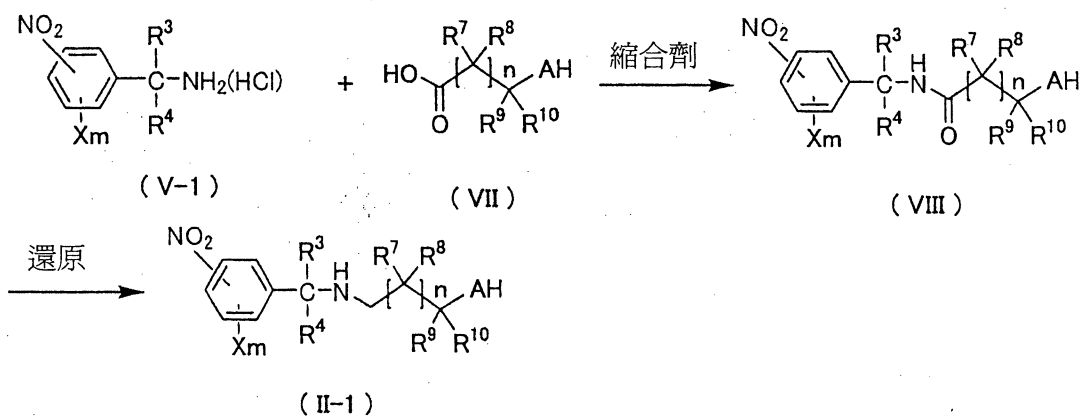
可使用於本反應的惰性溶劑，係不會明顯地抑制本反應進行者即可，例如二乙醚、四氫呋喃、二噁烷等鏈狀或環狀醚類、苯、甲苯、二甲苯等芳香族烴類、二甲基甲醯胺、N-甲基乙醯胺、N-甲基吡咯烷酮、六甲基磷醯胺等醯胺類、二氯甲烷、三氯甲烷、四氯化碳等鹵化烴類、氯苯、二氯苯等鹵化芳香族烴類等惰性溶劑，這些惰性溶劑係可單獨使用或混合 2 種以上而使用。

可使用於本反應的鹼，例如三乙胺、二異丙基乙胺、1,8-二雜氮二環 [5.4.0]-7-十一烯、吡啶等含氮有機鹼類、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鈉、氫氧化鈉、氫氧化鉀、氫化

鈉、金屬鈉等無機鹼類、醋酸鈉、醋酸鉀等有機鹼類、乙醇鈉、第三丁醇鉀等醇鹽類等。鹼之用量，係可適當地選自相對於通式 (V) 表示的硝基苯類，約 0.5~5 倍莫耳之範圍。因本反應係等莫耳反應，等莫耳使用各反應劑即可，惟亦可過剩地使用任一反應劑。

反應溫度係可選自約 0~150°C 之範圍，反應時間係依據反應規模、反應溫度等而異，適當地選自數分鐘至約 48 小時之範圍即可。反應結束後，依據常法自含有目的物的反應系單離出目的物，可依需求藉由再結晶法、蒸餾法、管柱層析法等進行精製而製造目的物。又本反應結束後，亦可不單離目的物而供予其次之反應。

中間體製造方法 2



(式中，R³、R⁴、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、A、X、W、m 及 n 係與上述相同。)

藉由使通式 (V-1) 表示的硝基苯類和通式 (VII) 表示的羧酸在縮合劑的存在下，在鹼及惰性溶劑的存在下或不存在下進行反應，作為通式 (VIII) 表示的醯胺衍生物，

單離或不單離該醯胺衍生物，藉由使醯胺還原，可製造通式 (II-1) 表示的硝化合物。

2-1) 通式 (V-1) 或通式 (VII) \rightarrow 通式 (VIII)

使用於本反應的縮合劑，例如氰磷酸二乙酯 (DEPC)、羰二咪唑 (CDI)、1,3-二環己基碳化二亞胺 (DCC)、氯碳酸酯類、碘化 2-氯-1-甲基吡啶鎂等，其用量相對於通式 (V-1) 或通式 (VII) 表示的硝基苯類或羧酸，係可選自等莫耳至過剩莫耳之範圍。

可使用於本反應的鹼係例如無機鹼或有機鹼，無基鹼例如氫氧化鈉、氫氧化鉀等鹼金屬原子的氫氧化物或氫化鈉、氫化鉀等鹼金屬的氫化物、乙醇鈉、第三丁醇鉀等醇的鹼金屬鹽、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鈉等碳酸鹽類，有機鹼例如三乙胺、吡啶、DBU 等，其用量相對於通式 (V-1) 或通式 (VII) 表示的硝基苯類或羧酸，係可選自等莫耳至過剩莫耳之範圍。

可使用於本反應的惰性溶劑，係不會明顯地抑制本反應進行者即可，例如苯、甲苯、二甲苯等芳香族烴類、二氯甲烷、三氯甲烷、四氯化碳等鹵化烴類、氯苯、二氯苯等鹵化芳香族烴類、二乙醚、二噁烷、四氫呋喃等鏈狀或環狀醚類、醋酸乙酯等酯類、二甲基甲醯胺、二甲基乙醯胺等醯胺類、二甲基亞砷、1,3-二甲基-2-咪唑二酮及丙酮、甲基乙酮等惰性溶劑，這些惰性溶劑係可單獨使用或混合 2 種以上而使用。

因本反應係等莫耳反應，等莫耳使用各反應劑即可，惟亦可過剩地使用任一反應劑，反應溫度係可於室溫至使用的惰性溶劑的沸點之範圍內，反應時間係依據反應規模、反應溫度等而異，適當地選自數分鐘至約 48 小時之範圍即可。

反應結束後，依據常法自含有目的物的反應系單離出目的物，可依需求藉由再結晶法、蒸餾法、管柱層析法等進行精製而製造目的物。又本反應結束後，亦可不單離目的物而供予其次之反應。

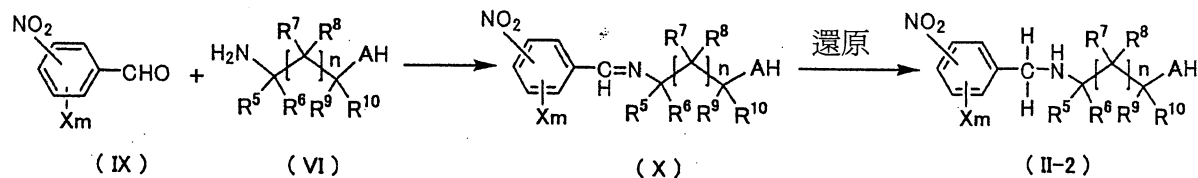
2-2) 通式 (VIII) \rightarrow 通式 (II-1)

可使用於本反應的還原劑例如硼氫化鈉、硼氫化鋰、硼氫化鋅、氫化鋰鋁、二異丁基氫化鋁等金屬氫配位化合物。還原劑之用量，係適當地選自相對於通式 (VIII) 表示的醯胺衍生物，約 0.25~10 倍莫耳之範圍即可。

可使用於本反應的惰性溶劑係不會明顯地抑制本反應進行者即可，例如甲醇、乙醇等醇類、四氫呋喃、二噁烷等醚類、二氯甲烷、三氯甲烷、四氯化碳等鹵化烴類、水等，這些惰性溶劑係可單獨使用或混合 2 種以上而使用。反應溫度係選自約 0~150°C 之範圍即可，反應時間係依據反應規模、反應溫度等而異，適當地選自數分鐘至約 48 小時之範圍即可。反應結束後，依據常法自含有目的物的反應系單離出目的物，可依需求藉由再結晶法、蒸餾法、管柱層析法等進行精製而製造目的物。又本反應結束後，亦可

不單離目的物而供予其次之反應。

中間體製造方法 3



(式中， R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^9 、 R^{10} 、A、X、W、m 及 n 係與上述相同。)

藉由使通式 (IX) 表示的苯甲醛類和通式 (VI) 表示的胺類在酸催化劑的存在下，在惰性溶劑的存在下或不存在下進行反應，作為通式 (X) 表示的亞胺衍生物，單離或不單離該亞胺衍生物，藉由使亞胺還原，可製造通式 (II-2) 表示的硝化合物。

3-1) 通式 (IX) \longrightarrow 通式 (X)

可使用於本反應的酸催化劑例如鹽酸、硫酸等磺酸類、甲酸、醋酸、三氟醋酸等有機酸類、甲磺酸、三氟甲磺酸、對甲苯基磺酸等磺酸類。酸催化劑之用量，係可適當地選自相對於通式 (IX) 表示的苯甲醛類，約 0.001~0.5 倍莫耳之範圍。

可使用於本反應的惰性溶劑係不會明顯地抑制本反應進行者即可，例如二乙醚、四氫呋喃、二噁烷等鏈狀或環狀醚類、苯、甲苯、二甲苯等芳香族烴類、二氯甲烷、三氯甲烷、四氯化碳等鹵化烴類、氯苯、二氯苯等鹵化芳香族烴類等惰性溶劑，這些惰性溶劑係可單獨使用或混合 2 種以上而使用。

反應溫度係選自約 0~150℃ 之範圍即可，反應時間係依據反應規模、反應溫度等而異，惟適當地選自數分鐘至約 48 小時之範圍。反應結束後，依據常法自含有目的物的反應系單離出目的物，可依需求藉由再結晶法、蒸餾法、管柱層析法等進行精製而製造目的物。又本反應結束後，亦可不單離目的物而供予其次之反應。

3-2) 通式 (X) ----> 通式 (II-2)

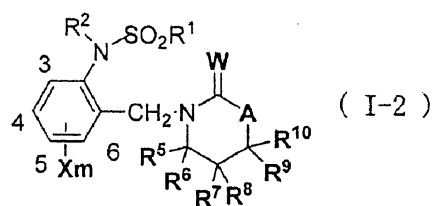
本反應係依據亞胺衍生物的一般還原方法（參考例如日本化學會編，「新實驗化學講座」，15 卷，p.198~199,1977 年，丸善股份公司）而進行即可。

以下，第 1 表及第 2 表係表示本發明的通式 (I) 所示的鹵烷基磺苯胺衍生物之代表例，其中間體係如第 3 表至第 6 表所示，惟本發明不受限於此。又，第 5 表的物性欄中，記載為「NMR」化合物的 ¹H-NMR 之數據係表示於第 7 表。表中，「Me」係表示為甲基，「Et」係表示為乙基，「Pr」係表示為丙基，「Bu」係表示為丁基，「Pen」係表示為戊基，「Ph」係表示為苯基，「n-」係表示為正，「i-」係表示為異，「s-」係表示為第二，「t-」係表示為第三，「neo-」係表示為新，「c-」係表示為脂環族烴基。

「取代位置」係表示在各個結構式中，苯環上的鹵烷基磺醯胺基之取代位置，物性係表示為熔點 (°C) 或折射率 n_D (測定溫度 °C) 。

【表1-1】

通式 (I)

第1表 (m=0、A=O、R¹=CF₃、R⁵=R⁶=H)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-1	H	H	H	H	H	O	1.4952(22)
1-2	CO ₂ Me	H	H	H	H	O	
1-3	CO ₂ Et	H	H	H	H	O	
1-4	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	H	O	1.4977(24)
1-5	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	H	O	1.4888(24)
1-6	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	H	O	1.4875(22)
1-7	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	H	O	
1-8	Me	H	H	H	H	O	
1-9	CH ₂ OMe	H	H	H	H	O	
1-10	CH ₂ OEt	H	H	H	H	O	
1-11	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	H	O	
1-12	H	H	H	H	H	S	113.3-117.2
1-13	CO ₂ Me	H	H	H	H	S	113.3-119.0
1-14	CO ₂ Et	H	H	H	H	S	142.8-144.1
1-15	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	H	S	74.9-77.4
1-16	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	H	S	1.5311(23)
1-17	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	H	S	1.5223(23)
1-18	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	H	S	
1-19	Me	H	H	H	H	S	
1-20	CH ₂ OMe	H	H	H	H	S	
1-21	CH ₂ OEt	H	H	H	H	S	
1-22	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	H	S	
1-23	H	Me	Me	H	H	O	126.5-128.3
1-24	CO ₂ Me	Me	Me	H	H	O	
1-25	CO ₂ Et	Me	Me	H	H	O	1.4882(22)
1-26	CO ₂ <i>n</i> -Pr	Me	Me	H	H	O	1.4835(21)
1-27	CO ₂ <i>n</i> -Bu	Me	Me	H	H	O	1.4873(21)
1-28	CO ₂ <i>i</i> -Bu	Me	Me	H	H	O	1.4792(23)
1-29	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	Me	Me	H	H	O	
1-30	Me	Me	Me	H	H	O	
1-31	CH ₂ OMe	Me	Me	H	H	O	
1-32	CH ₂ OEt	Me	Me	H	H	O	

【表1-2】

第1表(續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-33	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	Me	Me	H	H	O	
1-34	H	Me	Me	H	H	S	129.9
1-35	CO ₂ Me	Me	Me	H	H	S	1.5295(26)
1-36	CO ₂ Et	Me	Me	H	H	S	1.5223(26)
1-37	CO ₂ <i>n</i> -Pr	Me	Me	H	H	S	
1-38	CO ₂ <i>n</i> -Bu	Me	Me	H	H	S	
1-39	CO ₂ <i>i</i> -Bu	Me	Me	H	H	S	1.5159(26)
1-40	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	Me	Me	H	H	S	
1-41	Me	Me	Me	H	H	S	
1-42	CH ₂ OMe	Me	Me	H	H	S	
1-43	CH ₂ OEt	Me	Me	H	H	S	
1-44	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	Me	Me	H	H	S	
1-45	H	H	H	Me	Me	O	1.4985(25)
1-46	CO ₂ Me	H	H	Me	Me	O	
1-47	CO ₂ Et	H	H	Me	Me	O	1.4856(28)
1-48	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	Me	O	
1-49	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	Me	O	
1-50	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	Me	O	1.4860(28)
1-51	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	Me	O	138.4
1-52	CO ₂ (CH ₂) ₄ Me	H	H	Me	Me	O	1.4879(22)
1-53	CO ₂ CH ₂ Et(<i>n</i> -Bu)	H	H	Me	Me	O	96.1-99.5
1-54	Me	H	H	Me	Me	O	1.4949(26)
1-55	CH ₂ OMe	H	H	Me	Me	O	1.4921(27)
1-56	CH ₂ OEt	H	H	Me	Me	O	
1-57	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	Me	O	
1-58	H	H	H	Me	Me	S	136.5-137.1
1-59	CO ₂ Me	H	H	Me	Me	S	
1-60	CO ₂ Et	H	H	Me	Me	S	
1-61	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	Me	S	
1-62	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	Me	S	
1-63	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	Me	S	1.5130(26)
1-64	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	Me	S	1.5151(22)
1-65	Me	H	H	Me	Me	S	
1-66	CH ₂ OMe	H	H	Me	Me	S	
1-67	CH ₂ OEt	H	H	Me	Me	S	
1-68	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	Me	S	
1-69	H	H	H	Me	Et	O	102.9-106.8
1-70	CO ₂ Me	H	H	Me	Et	O	
1-71	CO ₂ Et	H	H	Me	Et	O	1.4906(20)

【表1-3】
第1表(續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-72	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	Et	0	
1-73	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	Et	0	
1-74	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	Et	0	72.0-75.7
1-75	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	Et	0	1.4880(21)
1-76	Me	H	H	Me	Et	0	
1-77	CH ₂ OMe	H	H	Me	Et	0	
1-78	CH ₂ OEt	H	H	Me	Et	0	
1-79	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	Et	0	
1-80	H	H	H	Me	CF ₃	0	1.4751(22)
1-81	CO ₂ Me	H	H	Me	CF ₃	0	103.8-105.1
1-82	CO ₂ Et	H	H	Me	CF ₃	0	131.1
1-83	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CF ₃	0	
1-84	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CF ₃	0	
1-85	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CF ₃	0	105.5
1-86	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CF ₃	0	39.5
1-87	Me	H	H	Me	CF ₃	0	
1-88	CH ₂ OMe	H	H	Me	CF ₃	0	
1-89	CH ₂ OEt	H	H	Me	CF ₃	0	
1-90	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CF ₃	0	
1-91	H	H	H	Et	CF ₃	0	106.7
1-92	CO ₂ Me	H	H	Et	CF ₃	0	1.4540(20)
1-93	CO ₂ Et	H	H	Et	CF ₃	0	75.6-76.2
1-94	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	CF ₃	0	59.9-60.4
1-95	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	CF ₃	0	1.4723(22)
1-96	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	CF ₃	0	1.4700(24)
1-97	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	CF ₃	0	
1-98	Me	H	H	Et	CF ₃	0	
1-99	CH ₂ OMe	H	H	Et	CF ₃	0	
1-100	CH ₂ OEt	H	H	Et	CF ₃	0	95.3
1-101	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	CF ₃	0	
1-102	H	H	H	Et	Et	0	121.9
1-103	CO ₂ Me	H	H	Et	Et	0	
1-104	CO ₂ Et	H	H	Et	Et	0	1.4892(22)
1-105	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	Et	0	
1-106	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	Et	0	
1-107	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	Et	0	1.4871(22)
1-108	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	Et	0	1.4813(22)
1-109	CO ₂ CH ₂ Et(<i>n</i> -Bu)	H	H	Et	Et	0	78
1-110	Me	H	H	Et	Et	0	

【表 1-4】
第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-111	CH ₂ OMe	H	H	Et	Et	O	131.8-133.2
1-112	CH ₂ OEt	H	H	Et	Et	O	
1-113	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	Et	O	
1-114	H	H	H	Et	Et	S	
1-115	CO ₂ Me	H	H	Et	Et	S	
1-116	CO ₂ Et	H	H	Et	Et	S	
1-117	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	Et	S	
1-118	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	Et	S	
1-119	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	Et	S	
1-120	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	Et	S	
1-121	Me	H	H	Et	Et	S	1.5081(22)
1-122	CH ₂ OMe	H	H	Et	Et	S	
1-123	CH ₂ OEt	H	H	Et	Et	S	
1-124	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	Et	S	
1-125	H	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-126	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-127	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-128	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-129	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-130	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-131	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-132	Me	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	68.5-70.4
1-133	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-134	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-135	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-136	CH ₂ OC(=O) <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	
1-137	H	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-138	CO ₂ Me	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-139	CO ₂ Et	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-140	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-141	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-142	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-143	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-144	CO ₂ CH ₂ Et(<i>n</i> -Bu)	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-145	Me	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-146	CH ₂ OMe	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-147	CH ₂ OEt	H	H		(CH ₂) ₄	O	
1-148	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H		(CH ₂) ₄	O	

【表 1 - 5】
第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-149	H	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	0	1.5123(26)
1-150	CO ₂ Me	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	0	
1-151	CO ₂ Et	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	0	
1-152	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	0	
1-153	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	0	
1-154	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	0	1.4972(25)
1-155	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	0	1.4970(25)
1-156	Me	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	0	
1-157	CH ₂ OMe	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	0	
1-158	CH ₂ OEt	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	0	
1-159	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	0	
1-160	H	H	H	Me	Ph	0	119.1-121.8
1-161	CO ₂ Me	H	H	Me	Ph	0	
1-162	CO ₂ Et	H	H	Me	Ph	0	1.5220(21)
1-163	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	Ph	0	
1-164	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	Ph	0	
1-165	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	Ph	0	1.5121(21)
1-166	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	Ph	0	
1-167	Me	H	H	Me	Ph	0	41.9-42.1
1-168	CH ₂ OMe	H	H	Me	Ph	0	
1-169	CH ₂ OEt	H	H	Me	Ph	0	
1-170	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	Ph	0	
1-171	CH ₂ O(CH ₂) ₂ OMe	H	H	Me	Ph	0	1.5169(22)
1-172	H	H	H	Me	2-Cl-Ph	0	1.5381(25)
1-173	CO ₂ Me	H	H	Me	2-Cl-Ph	0	
1-174	CO ₂ Et	H	H	Me	2-Cl-Ph	0	1.5220(26)
1-175	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-Cl-Ph	0	
1-176	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-Cl-Ph	0	
1-177	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-Cl-Ph	0	1.5180(26)
1-178	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-Cl-Ph	0	
1-179	Me	H	H	Me	2-Cl-Ph	0	
1-180	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-Cl-Ph	0	
1-181	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-Cl-Ph	0	
1-182	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2-Cl-Ph	0	
1-183	H	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	0	127.5
1-184	CO ₂ Me	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	0	
1-185	CO ₂ Et	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	0	1.5190(26)
1-186	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	0	
1-187	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	0	

【表 1 - 6】
第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-188	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	1.5198(25)
1-189	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	
1-190	Me	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	
1-191	CH ₂ OMe	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	1.5112(25)
1-192	CH ₂ OEt	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	
1-193	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	
1-194	CH ₂ OCH ₂ Ph	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	1.5389(24)
1-195	H	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	57.6-62.5
1-196	CO ₂ Me	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-197	CO ₂ Et	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	1.5281(26)
1-198	CO ₂ <i>m</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-199	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-200	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-201	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-202	Me	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-203	CH ₂ OMe	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-204	CH ₂ OEt	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-205	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	
1-206	H	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	60.4-64.5
1-207	CO ₂ Me	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-208	CO ₂ Et	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	1.5193(25)
1-209	CO ₂ <i>m</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-210	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-211	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	44.3-47.8
1-212	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-213	Me	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-214	CH ₂ OMe	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-215	CH ₂ OEt	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-216	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	
1-217	H	H	H	Ph	Ph	O	170.5
1-218	CO ₂ Me	H	H	Ph	Ph	O	
1-219	CO ₂ Et	H	H	Ph	Ph	O	1.5415(27)
1-220	CO ₂ <i>m</i> -Pr	H	H	Ph	Ph	O	
1-221	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Ph	Ph	O	
1-222	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Ph	Ph	O	
1-223	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Ph	Ph	O	
1-224	Me	H	H	Ph	Ph	O	158.9
1-225	CH ₂ OMe	H	H	Ph	Ph	O	
1-226	CH ₂ OEt	H	H	Ph	Ph	O	

【表 1 - 7】

第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-227	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Ph	Ph	O	
1-228	H	H	H	CF ₃	Ph	O	185.4
1-229	CO ₂ Me	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-230	CO ₂ Et	H	H	CF ₃	Ph	O	1.4909(26)
1-231	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-232	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-233	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-234	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-235	Me	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-236	CH ₂ OMe	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-237	CH ₂ OEt	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-238	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	CF ₃	Ph	O	
1-239	H	H	H	H	Ph	O	152
1-240	CO ₂ Me	H	H	H	Ph	O	
1-241	CO ₂ Et	H	H	H	Ph	O	143.9
1-242	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	Ph	O	
1-243	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	Ph	O	
1-244	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	Ph	O	163.7
1-245	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	Ph	O	
1-246	Me	H	H	H	Ph	O	153.2
1-247	CH ₂ OMe	H	H	H	Ph	O	
1-248	CH ₂ OEt	H	H	H	Ph	O	115.6
1-249	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	Ph	O	
1-250	H	H	H	H	2-F-Ph	O	1.5349(26)
1-251	CO ₂ Me	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-252	CO ₂ Et	H	H	H	2-F-Ph	O	145.5
1-253	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-254	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-255	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	2-F-Ph	O	169.7
1-256	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-257	Me	H	H	H	2-F-Ph	O	1.5765(26)
1-258	CH ₂ OMe	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-259	CH ₂ OEt	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-260	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	2-F-Ph	O	
1-261	H	Me	Me	H	Ph	O	132.9
1-262	CO ₂ Me	Me	Me	H	Ph	O	
1-263	CO ₂ Et	Me	Me	H	Ph	O	1.5119(23)
1-264	CO ₂ <i>n</i> -Pr	Me	Me	H	Ph	O	
1-265	CO ₂ <i>n</i> -Bu	Me	Me	H	Ph	O	

【表 1-8】
第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-266	CO ₂ <i>i</i> -Bu	Me	Me	H	Ph	0	
1-267	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	Me	Me	H	Ph	0	
1-268	Me	Me	Me	H	Ph	0	1.5240(23)
1-269	CH ₂ OMe	Me	Me	H	Ph	0	
1-270	CH ₂ OEt	Me	Me	H	Ph	0	1.5092(23)
1-271	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	Me	Me	H	Ph	0	
1-272	H	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	0	1.5386(20)
1-273	CO ₂ Me	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	0	
1-274	CO ₂ Et	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	0	1.5181(20)
1-275	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	0	
1-276	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	0	
1-277	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	0	
1-278	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	0	
1-279	Me	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	0	1.5155(21)
1-280	CH ₂ OMe	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	0	
1-281	CH ₂ OEt	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	0	1.5292(20)
1-282	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	0	
1-283	H	H	H	H	2-Me-Ph	0	1.5407(22)
1-284	CO ₂ Me	H	H	H	2-Me-Ph	0	
1-285	CO ₂ Et	H	H	H	2-Me-Ph	0	1.5160(21)
1-286	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	2-Me-Ph	0	
1-287	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	2-Me-Ph	0	
1-288	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	2-Me-Ph	0	
1-289	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	2-Me-Ph	0	
1-290	Me	H	H	H	2-Me-Ph	0	1.5179(21)
1-291	CH ₂ OMe	H	H	H	2-Me-Ph	0	
1-292	CH ₂ OEt	H	H	H	2-Me-Ph	0	1.5235(21)
1-293	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	2-Me-Ph	0	
1-294	H	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	0	181.2
1-295	CO ₂ Me	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	0	
1-296	CO ₂ Et	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	0	1.4997(18)
1-297	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	0	
1-298	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	0	
1-299	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	0	
1-300	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	0	
1-301	Me	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	0	1.5017(18)
1-302	CH ₂ OMe	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	0	
1-303	CH ₂ OEt	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	0	1.5029(18)
1-304	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	0	

【表1-9】
第1表(續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-305	H	H	H	H	2-Cl-Ph	O	1.5351(23)
1-306	CO ₂ Me	H	H	H	2-Cl-Ph	O	
1-307	CO ₂ Et	H	H	H	2-Cl-Ph	O	133.0-135.5
1-308	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	2-Cl-Ph	O	
1-309	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	2-Cl-Ph	O	
1-310	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	2-Cl-Ph	O	
1-311	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	2-Cl-Ph	O	
1-312	Me	H	H	H	2-Cl-Ph	O	1.5256(22)
1-313	CH ₂ OMe	H	H	H	2-Cl-Ph	O	
1-314	CH ₂ OEt	H	H	H	2-Cl-Ph	O	1.5263(22)
1-315	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	2-Cl-Ph	O	
1-316	H	H	H	Et	Ph	O	120.8-122.4
1-317	CO ₂ Me	H	H	Et	Ph	O	1.5229(21)
1-318	CO ₂ Et	H	H	Et	Ph	O	1.5249(22)
1-319	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	Ph	O	
1-320	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	Ph	O	
1-321	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	Ph	O	1.5192(22)
1-322	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	Ph	O	
1-323	Me	H	H	Et	Ph	O	51.0-52.0
1-324	CH ₂ OMe	H	H	Et	Ph	O	
1-325	CH ₂ OEt	H	H	Et	Ph	O	
1-326	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	Ph	O	
1-327	H	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	156.4
1-328	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-329	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	102.2-104.0
1-330	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-331	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-332	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	104.2
1-333	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-334	Me	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-335	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-336	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-337	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	
1-338	H	H	H	CF ₃	CF ₃	O	113.7
1-339	CO ₂ Me	H	H	CF ₃	CF ₃	O	103.8-105.1
1-340	CO ₂ Et	H	H	CF ₃	CF ₃	O	102.4
1-341	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	CF ₃	CF ₃	O	
1-342	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	CF ₃	CF ₃	O	
1-343	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	CF ₃	CF ₃	O	1.4542(22)

【表1-10】
第1表(續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-344	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	CF ₃	CF ₃	O	
1-345	Me	H	H	CF ₃	CF ₃	O	
1-346	CH ₂ OMe	H	H	CF ₃	CF ₃	O	
1-347	CH ₂ OEt	H	H	CF ₃	CF ₃	O	
1-348	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	CF ₃	CF ₃	O	
1-349	H	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	48.0
1-350	CO ₂ Me	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	1.4992(21)
1-351	CO ₂ Et	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	154.0-156.0
1-352	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-353	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-354	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-355	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-356	Me	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-357	CH ₂ OMe	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-358	CH ₂ OEt	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-359	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-360	H	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	187.4
1-361	CO ₂ Me	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	68.6-72.5
1-362	CO ₂ Et	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	1.5252(22)
1-363	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-364	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-365	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-366	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-367	Me	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-368	CH ₂ OMe	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-369	CH ₂ OEt	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	1.5229(22)
1-370	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	
1-371	H	H	H	Me	1-Me-1- <i>c</i> -Pr	O	84.0-86.3
1-372	CO ₂ Me	H	H	Me	1-Me-1- <i>c</i> -Pr	O	
1-373	CO ₂ Et	H	H	Me	1-Me-1- <i>c</i> -Pr	O	79.9-81.5
1-374	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	1-Me-1- <i>c</i> -Pr	O	
1-375	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	1-Me-1- <i>c</i> -Pr	O	
1-376	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	1-Me-1- <i>c</i> -Pr	O	1.4951(23)
1-377	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	1-Me-1- <i>c</i> -Pr	O	1.5010(23)
1-378	Me	H	H	Me	1-Me-1- <i>c</i> -Pr	O	
1-379	CH ₂ OMe	H	H	Me	1-Me-1- <i>c</i> -Pr	O	
1-380	CH ₂ OEt	H	H	Me	1-Me-1- <i>c</i> -Pr	O	
1-381	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	1-Me-1- <i>c</i> -Pr	O	
1-382	H	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	136.8-137.2

【表 1-11】

第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-383	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	
1-384	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	1.5001(21)
1-385	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	
1-386	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	
1-387	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	80.3-81.3
1-388	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	94.6-95.8
1-389	Me	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	
1-390	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	
1-391	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	
1-392	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>c</i> -Bu	O	
1-393	H	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	1.4995(25)
1-394	CO ₂ Me	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	1.5005(26)
1-395	CO ₂ Et	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	1.4951(26)
1-396	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	
1-397	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	
1-398	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	
1-399	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	
1-400	Me	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	
1-401	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	
1-402	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	
1-403	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	
1-404	H	H	H	Me	2-Me-Ph	O	1.5123(24)
1-405	CO ₂ Me	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-406	CO ₂ Et	H	H	Me	2-Me-Ph	O	1.5250(24)
1-407	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-408	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-409	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-410	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-411	Me	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-412	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-413	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-414	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2-Me-Ph	O	
1-415	CO ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	H	H	Et	CF ₃	O	1.4799(20)
1-416	CO ₂ CH ₂ CCl ₃	H	H	Et	CF ₃	O	1.4845(20)
1-417	H	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	123.8-124.7
1-418	CO ₂ Me	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	
1-419	CO ₂ Et	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	1.4916(24)
1-420	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	
1-421	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	

【表1-12】

第1表(續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-422	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	1.4904(24)
1-423	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	1.4829(24)
1-424	Me	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	
1-425	CH ₂ OMe	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	
1-426	CH ₂ OEt	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	
1-427	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	
1-428	H	H	H	Me	2-F-Ph	O	1.5212(27)
1-429	CO ₂ Me	H	H	Me	2-F-Ph	O	1.5051(26)
1-430	CO ₂ Et	H	H	Me	2-F-Ph	O	1.4950(26)
1-431	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-432	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-433	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-434	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-435	Me	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-436	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-437	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-438	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2-F-Ph	O	
1-439	H	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	1.4982(27)
1-440	CO ₂ Me	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	1.5005(25)
1-441	CO ₂ Et	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	1.4871(25)
1-442	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-443	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-444	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-445	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-446	Me	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-447	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-448	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-449	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,6-F ₂ -Ph	O	
1-450	H	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	163.7-164.2
1-451	CO ₂ Me	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	
1-452	CO ₂ Et	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	1.4873(24)
1-453	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	
1-454	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	
1-455	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	1.4842(24)
1-456	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	1.4821(24)
1-457	Me	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	
1-458	CH ₂ OMe	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	
1-459	CH ₂ OEt	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	
1-460	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	

【表1-13】
第1表(續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-461	H	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	143.1
1-462	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-463	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	1.4962(23)
1-464	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-465	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-466	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-467	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-468	Me	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-469	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-470	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-471	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
1-472	H	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	1.5348(25)
1-473	CO ₂ Me	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	1.5275(25)
1-474	CO ₂ Et	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	1.5330(25)
1-475	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-476	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-477	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-478	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-479	Me	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-480	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-481	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-482	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	
1-483	H	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	183.6
1-484	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-485	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	1.5270(25)
1-486	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-487	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-488	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-489	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-490	Me	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-491	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-492	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-493	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
1-494	H	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	114.1-115.0
1-495	CO ₂ Me	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	1.4935(27)
1-496	CO ₂ Et	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	1.4905(25)
1-497	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	1.4830(27)
1-498	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	
1-499	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	1.4840(25)

【表 1-14】

第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-500	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	0	
1-501	CO ₂ Ph	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	0	1.5069(25)
1-502	Me	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	0	
1-503	CH ₂ OMe	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	0	
1-504	CH ₂ OEt	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	0	
1-505	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	0	
1-506	CO ₂ Ph	H	H	Me	Me	0	1.5187(26)
1-507	H	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	0	127.6-129.2
1-508	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	0	
1-509	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	0	1.4820(25)
1-510	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	0	
1-511	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	0	
1-512	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	0	90.9-92.6
1-513	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	0	
1-514	CO ₂ Ph	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	0	
1-515	Me	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	0	
1-516	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	0	
1-517	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	0	
1-518	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	0	
1-519	H	H	H	Me	3-Cl-Ph	0	1.5275(24)
1-520	CO ₂ Me	H	H	Me	3-Cl-Ph	0	52
1-521	CO ₂ Et	H	H	Me	3-Cl-Ph	0	1.5225(25)
1-522	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3-Cl-Ph	0	
1-523	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3-Cl-Ph	0	
1-524	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3-Cl-Ph	0	
1-525	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3-Cl-Ph	0	
1-526	CO ₂ Ph	H	H	Me	3-Cl-Ph	0	
1-527	Me	H	H	Me	3-Cl-Ph	0	
1-528	CH ₂ OMe	H	H	Me	3-Cl-Ph	0	
1-529	CH ₂ OEt	H	H	Me	3-Cl-Ph	0	
1-530	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3-Cl-Ph	0	
1-531	H	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	0	147.0-149.4
1-532	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	0	
1-533	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	0	1.5086(26)
1-534	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	0	
1-535	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	0	
1-536	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	0	
1-537	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	0	
1-538	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	0	

【表1-15】
第1表(續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-539	Me	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	0	
1-540	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	0	
1-541	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	0	
1-542	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	0	
1-543	H	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	0	127.7-131.1
1-544	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	0	
1-545	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	0	1.5252(24)
1-546	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	0	
1-547	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	0	
1-548	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	0	
1-549	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	0	
1-550	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	0	
1-551	Me	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	0	
1-552	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	0	
1-553	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	0	
1-554	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	0	
1-555	H	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	0	125.0-126.8
1-556	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	0	
1-557	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	0	1.5166(24)
1-558	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	0	
1-559	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	0	
1-560	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	0	
1-561	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	0	
1-562	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	0	
1-563	Me	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	0	
1-564	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	0	
1-565	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	0	
1-566	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	0	
1-567	H	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	0	1.5012(26)
1-568	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	0	
1-569	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	0	1.4994(26)
1-570	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	0	
1-571	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	0	
1-572	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	0	
1-573	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	0	
1-574	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	0	
1-575	Me	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	0	
1-576	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	0	
1-577	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	0	

【表1-16】
第1表(續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-578	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	
1-579	H	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	190.2-193.0
1-580	CO ₂ Me	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-581	CO ₂ Et	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	1.5266(26)
1-582	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-583	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-584	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-585	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-586	CO ₂ Ph	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-587	Me	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-588	CH ₂ OMe	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-589	CH ₂ OEt	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-590	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
1-591	H	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	88.1-90.5
1-592	CO ₂ Me	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	1.4922(21)
1-593	CO ₂ Et	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	1.4778(24)
1-594	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	1.4925(21)
1-595	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-596	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	1.4804(24)
1-597	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-598	CO ₂ Ph	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-599	Me	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-600	CH ₂ OMe	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-601	CH ₂ OEt	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-602	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	
1-603	H	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	104.9
1-604	CO ₂ Me	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-605	CO ₂ Et	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	1.4829(24)
1-606	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-607	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-608	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	1.4846(24)
1-609	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-610	CO ₂ Ph	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-611	Me	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-612	CH ₂ OMe	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-613	CH ₂ OEt	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-614	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	
1-615	H	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	98.1-102.4
1-616	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	

【表 1-17】
第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-617	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	0	1.4761(24)
1-618	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	0	
1-619	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	0	
1-620	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	0	1.4738(24)
1-621	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	0	
1-622	CO ₂ Ph	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	0	
1-623	Me	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	0	
1-624	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	0	
1-625	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	0	
1-626	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	0	
1-627	H	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	0	105.9-108.2
1-628	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	0	
1-629	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	0	1.4839(28)
1-630	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	0	
1-631	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	0	
1-632	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	0	1.4851(28)
1-633	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	0	
1-634	CO ₂ Ph	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	0	
1-635	Me	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	0	
1-636	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	0	
1-637	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	0	
1-638	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	0	
1-639	H	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	0	79.5-82.0
1-640	CO ₂ Me	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	0	
1-641	CO ₂ Et	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	0	1.4831(26)
1-642	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	0	
1-643	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	0	
1-644	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	0	1.4746(26)
1-645	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	0	
1-646	CO ₂ Ph	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	0	
1-647	Me	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	0	
1-648	CH ₂ OMe	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	0	
1-649	CH ₂ OEt	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	0	
1-650	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	0	
1-651	H	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	0	89.7-92.4
1-652	CO ₂ Me	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	0	
1-653	CO ₂ Et	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	0	1.4829(26)
1-654	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	0	
1-655	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	0	

【表 1-18】

第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-656	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	0	1.4822(26)
1-657	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	0	
1-658	CO ₂ Ph	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	0	
1-659	Me	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	0	
1-660	CH ₂ OMe	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	0	
1-661	CH ₂ OEt	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	0	
1-662	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	0	
1-663	H	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	0	1.4752(26)
1-664	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	0	
1-665	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	0	1.4642(26)
1-666	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	0	
1-667	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	0	
1-668	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	0	1.4669(26)
1-669	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	0	
1-670	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	0	
1-671	Me	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	0	
1-672	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	0	
1-673	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	0	
1-674	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	0	
1-675	H	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	0	
1-676	CO ₂ Me	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	0	
1-677	CO ₂ Et	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	0	
1-678	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	0	
1-679	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	0	
1-680	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	0	
1-681	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	0	
1-682	CO ₂ Ph	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	0	
1-683	Me	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	0	
1-684	CH ₂ OMe	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	0	
1-685	CH ₂ OEt	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	0	
1-686	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Pr	0	
1-687	H	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	0	
1-688	CO ₂ Me	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	0	
1-689	CO ₂ Et	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	0	
1-690	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	0	
1-691	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	0	
1-692	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	0	
1-693	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	0	
1-694	CO ₂ Ph	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	0	

【表1-19】
第1表(續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-695	Me	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	0	
1-696	CH ₂ OMe	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	0	
1-697	CH ₂ OEt	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	0	
1-698	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	CF ₃	<i>n</i> -Bu	0	
1-699	H	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	0	134.4-134.8
1-700	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	0	
1-701	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	0	1.5018(27)
1-702	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	0	
1-703	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	0	
1-704	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	0	
1-705	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	0	
1-706	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	0	
1-707	Me	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	0	
1-708	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	0	
1-709	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	0	
1-710	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	0	
1-711	H	H	H	Me	3-F-Ph	0	116.0-117.0
1-712	CO ₂ Me	H	H	Me	3-F-Ph	0	1.5023(26)
1-713	CO ₂ Et	H	H	Me	3-F-Ph	0	1.5109(26)
1-714	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3-F-Ph	0	
1-715	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3-F-Ph	0	
1-716	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3-F-Ph	0	
1-717	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3-F-Ph	0	
1-718	CO ₂ Ph	H	H	Me	3-F-Ph	0	
1-719	Me	H	H	Me	3-F-Ph	0	
1-720	CH ₂ OMe	H	H	Me	3-F-Ph	0	
1-721	CH ₂ OEt	H	H	Me	3-F-Ph	0	
1-722	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3-F-Ph	0	
1-723	H	H	H	Me	4-F-Ph	0	118.5
1-724	CO ₂ Me	H	H	Me	4-F-Ph	0	1.5082(22)
1-725	CO ₂ Et	H	H	Me	4-F-Ph	0	1.5005(22)
1-726	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	4-F-Ph	0	
1-727	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	4-F-Ph	0	
1-728	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	4-F-Ph	0	
1-729	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	4-F-Ph	0	
1-730	CO ₂ Ph	H	H	Me	4-F-Ph	0	
1-731	Me	H	H	Me	4-F-Ph	0	
1-732	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-F-Ph	0	
1-733	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-F-Ph	0	

【表 1-20】
第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-734	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	4-F-Ph	O	
1-735	H	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	1.5165(25)
1-736	CO ₂ Me	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	1.4939(25)
1-737	CO ₂ Et	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	1.4950(26)
1-738	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-739	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-740	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-741	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-742	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-743	Me	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-744	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-745	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-746	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	
1-747	H	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	136.2
1-748	CO ₂ Me	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	1.4875(24)
1-749	CO ₂ Et	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	1.4962(24)
1-750	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-751	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-752	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-753	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-754	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-755	Me	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-756	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-757	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-758	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	
1-759	H	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-760	CO ₂ Me	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-761	CO ₂ Et	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-762	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-763	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-764	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-765	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-766	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-767	Me	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-768	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-769	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-770	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-771	H	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-772	CO ₂ Me	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	

【表 1 - 2 1】

第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-773	CO ₂ Et	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-774	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-775	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-776	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-777	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-778	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-779	Me	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-780	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-781	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-782	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,5-Cl ₂ -Ph	O	
1-783	H	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-784	CO ₂ Me	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-785	CO ₂ Et	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-786	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-787	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-788	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-789	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-790	CO ₂ Ph	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-791	Me	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-792	CH ₂ OMe	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-793	CH ₂ OEt	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-794	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	3-Cl-Ph	O	
1-795	H	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-796	CO ₂ Me	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-797	CO ₂ Et	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-798	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-799	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-800	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-801	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-802	CO ₂ Ph	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-803	Me	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-804	CH ₂ OMe	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-805	CH ₂ OEt	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-806	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	4-Cl-Ph	O	
1-807	H	H	H	Et	3-F-Ph	O	1.5172(21)
1-808	CO ₂ Me	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-809	CO ₂ Et	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-810	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-811	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	3-F-Ph	O	

【表 1 - 2 2】

第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-812	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-813	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-814	CO ₂ Ph	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-815	Me	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-816	CH ₂ OMe	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-817	CH ₂ OEt	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-818	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	3-F-Ph	O	
1-819	H	H	H	Et	4-F-Ph	O	141.0-142.0
1-820	CO ₂ Me	H	H	Et	4-F-Ph	O	1.5150(27)
1-821	CO ₂ Et	H	H	Et	4-F-Ph	O	1.4905(27)
1-822	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-823	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-824	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-825	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-826	CO ₂ Ph	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-827	Me	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-828	CH ₂ OMe	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-829	CH ₂ OEt	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-830	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	4-F-Ph	O	
1-831	H	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	1.5004(25)
1-832	CO ₂ Me	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	1.4829(25)
1-833	CO ₂ Et	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-834	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-835	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-836	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-837	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-838	CO ₂ Ph	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-839	Me	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-840	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-841	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-842	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	
1-843	H	H	H	Me	2-Br-Ph	O	1.5350(27)
1-844	CO ₂ Me	H	H	Me	2-Br-Ph	O	1.5370(26)
1-845	CO ₂ Et	H	H	Me	2-Br-Ph	O	1.5239(27)
1-846	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-Br-Ph	O	
1-847	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-Br-Ph	O	
1-848	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-Br-Ph	O	
1-849	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-Br-Ph	O	
1-850	CO ₂ Ph	H	H	Me	2-Br-Ph	O	

【表1-23】
第1表(續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-851	Me	H	H	Me	2-Br-Ph	0	
1-852	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-Br-Ph	0	
1-853	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-Br-Ph	0	
1-854	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2-Br-Ph	0	
1-855	H	H	H	Me	3-Me-Ph	0	94.1-96.7
1-856	CO ₂ Me	H	H	Me	3-Me-Ph	0	1.5485(25)
1-857	CO ₂ Et	H	H	Me	3-Me-Ph	0	1.5402(25)
1-858	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3-Me-Ph	0	
1-859	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3-Me-Ph	0	
1-860	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3-Me-Ph	0	
1-861	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3-Me-Ph	0	
1-862	CO ₂ Ph	H	H	Me	3-Me-Ph	0	
1-863	Me	H	H	Me	3-Me-Ph	0	
1-864	CH ₂ OMe	H	H	Me	3-Me-Ph	0	
1-865	CH ₂ OEt	H	H	Me	3-Me-Ph	0	
1-866	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3-Me-Ph	0	
1-867	H	H	H	Me	4-Me-Ph	0	135.2-137.9
1-868	CO ₂ Me	H	H	Me	4-Me-Ph	0	
1-869	CO ₂ Et	H	H	Me	4-Me-Ph	0	1.5152(25)
1-870	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	4-Me-Ph	0	
1-871	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	4-Me-Ph	0	
1-872	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	4-Me-Ph	0	1.5075(26)
1-873	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	4-Me-Ph	0	
1-874	CO ₂ Ph	H	H	Me	4-Me-Ph	0	
1-875	Me	H	H	Me	4-Me-Ph	0	
1-876	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-Me-Ph	0	
1-877	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-Me-Ph	0	
1-878	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	4-Me-Ph	0	
1-879	H	H	H	Me	3-MeO-Ph	0	132.9-133.8
1-880	CO ₂ Me	H	H	Me	3-MeO-Ph	0	
1-881	CO ₂ Et	H	H	Me	3-MeO-Ph	0	1.5174(27)
1-882	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3-MeO-Ph	0	
1-883	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3-MeO-Ph	0	
1-884	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3-MeO-Ph	0	
1-885	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3-MeO-Ph	0	
1-886	CO ₂ Ph	H	H	Me	3-MeO-Ph	0	
1-887	Me	H	H	Me	3-MeO-Ph	0	
1-888	CH ₂ OMe	H	H	Me	3-MeO-Ph	0	
1-889	CH ₂ OEt	H	H	Me	3-MeO-Ph	0	

【表1-24】
第1表(續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-890	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	
1-891	H	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	119.9-122.0
1-892	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-893	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	1.5065(25)
1-894	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-895	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-896	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-897	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-898	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-899	Me	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-900	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-901	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-902	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	
1-903	H	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	109
1-904	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-905	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	1.5028(25)
1-906	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-907	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-908	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-909	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-910	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-911	Me	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-912	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-913	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-914	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	
1-915	H	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	116.6-118.5
1-916	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-917	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	1.5162(25)
1-918	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-919	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-920	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-921	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-922	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-923	Me	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-924	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-925	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-926	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	
1-927	H	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	136.7
1-928	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	

【表 1 - 2 5】

第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-929	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	69.6-73.8
1-930	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-931	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-932	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	94.4-95.7
1-933	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-934	CO ₂ Ph	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-935	Me	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-936	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-937	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-938	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	
1-939	H	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	111.6-112.3
1-940	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-941	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	1.4821(25)
1-942	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-943	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-944	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	66.9
1-945	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-946	CO ₂ Ph	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-947	Me	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-948	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-949	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-950	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	
1-951	H	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	1.5045(24)
1-952	CO ₂ Me	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	1.4917(25)
1-953	CO ₂ Et	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	1.4923(25)
1-954	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-955	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-956	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-957	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-958	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-959	Me	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-960	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-961	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-962	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	
1-963	H	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	133.0-133.3
1-964	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-965	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	1.5154(27)
1-966	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-967	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	

【表1-26】
第1表(續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-968	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-969	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-970	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-971	Me	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-972	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-973	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-974	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	
1-975	H	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	64.0-65.0
1-976	CO ₂ Me	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	1.5411(24)
1-977	CO ₂ Et	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	1.5468(24)
1-978	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-979	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-980	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-981	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-982	CO ₂ Ph	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-983	Me	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-984	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-985	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-986	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	
1-987	H	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	1.5012(25)
1-988	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-989	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	1.4930(24)
1-990	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-991	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-992	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	1.4871(24)
1-993	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	1.4809(24)
1-994	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-995	Me	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-996	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-997	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-998	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	
1-999	H	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	143.7
1-1000	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1001	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	1.5172(26)
1-1002	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1003	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1004	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1005	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1006	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	

【表 1 - 27】

第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-1007	Me	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1008	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1009	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1010	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	
1-1011	H	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	147.1-147.7
1-1012	CO ₂ Me	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1013	CO ₂ Et	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	152.8-153.6
1-1014	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1015	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1016	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1017	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1018	CO ₂ Ph	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1019	Me	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1020	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1021	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1022	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	
1-1023	H	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	1.5286(21)
1-1024	CO ₂ Me	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	1.5145(22)
1-1025	CO ₂ Et	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	1.5228(22)
1-1026	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1027	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1028	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1029	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1030	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1031	Me	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1032	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1033	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1034	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	
1-1035	H	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	1.5288(20)
1-1036	CO ₂ Me	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	1.5150(22)
1-1037	CO ₂ Et	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	1.5202(21)
1-1038	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1039	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1040	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1041	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1042	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1043	Me	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1044	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1045	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	

【表 1 - 28】

第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-1046	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	
1-1047	H	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	1.4991(21)
1-1048	CO ₂ Me	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1049	CO ₂ Et	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	1.4903(22)
1-1050	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1051	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1052	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	1.4849(22)
1-1053	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	1.4630(23)
1-1054	CO ₂ Ph	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1055	Me	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1056	CH ₂ OMe	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1057	CH ₂ OEt	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1058	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	
1-1059	H	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	136.9
1-1060	CO ₂ Me	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	64.1-69.8
1-1061	CO ₂ Et	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	1.5225(21)
1-1062	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1063	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1064	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1065	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1066	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1067	Me	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1068	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1069	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1070	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1071	H	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	73-76
1-1072	CO ₂ Me	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1073	CO ₂ Et	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	1.5210(19)
1-1074	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1075	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1076	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1077	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1078	CO ₂ Ph	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1079	Me	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1080	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1081	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1082	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	
1-1083	H	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	1.5288(19)
1-1084	CO ₂ Me	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	

【表 1-29】
第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-1085	CO ₂ Et	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	1.5168(19)
1-1086	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1087	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1088	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1089	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1090	CO ₂ Ph	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1091	Me	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1092	CH ₂ OMe	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1093	CH ₂ OEt	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1094	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	
1-1095	H	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	91-94
1-1096	CO ₂ Me	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1097	CO ₂ Et	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	1.5068(19)
1-1098	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1099	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1100	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1101	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1102	CO ₂ Ph	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1103	Me	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1104	CH ₂ OMe	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1105	CH ₂ OEt	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1106	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	
1-1107	H	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	117.8
1-1108	CO ₂ Me	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	1.5068(20)
1-1109	CO ₂ Et	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	1.5135(20)
1-1110	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1111	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1112	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1113	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1114	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1115	Me	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1116	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1117	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1118	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,4-Me ₂ -Ph	O	
1-1119	H	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	116.2
1-1120	CO ₂ Me	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	1.5070(21)
1-1121	CO ₂ Et	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	1.5102(21)
1-1122	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	
1-1123	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	O	

【表1-30】
第1表(續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-1124	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	0	
1-1125	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	0	
1-1126	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	0	
1-1127	Me	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	0	
1-1128	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	0	
1-1129	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	0	
1-1130	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,5-Me ₂ -Ph	0	
1-1131	H	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	0	
1-1132	CO ₂ Me	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	0	
1-1133	CO ₂ Et	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	0	
1-1134	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	0	
1-1135	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	0	
1-1136	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	0	
1-1137	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	0	
1-1138	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	0	
1-1139	Me	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	0	
1-1140	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	0	
1-1141	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	0	
1-1142	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,4,6-Me ₃ -Ph	0	
1-1143	H	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	0	
1-1144	CO ₂ Me	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	0	
1-1145	CO ₂ Et	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	0	
1-1146	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	0	
1-1147	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	0	
1-1148	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	0	
1-1149	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	0	
1-1150	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	0	
1-1151	Me	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	0	
1-1152	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	0	
1-1153	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	0	
1-1154	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,4-(MeO) ₂ -Ph	0	
1-1155	H	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	0	
1-1156	CO ₂ Me	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	0	
1-1157	CO ₂ Et	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	0	
1-1158	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	0	
1-1159	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	0	
1-1160	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	0	
1-1161	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	0	
1-1162	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	0	

【表 1-31】

第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-1163	Me	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1164	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1165	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1166	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1167	H	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1168	CO ₂ Me	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1169	CO ₂ Et	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1170	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1171	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1172	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1173	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1174	CO ₂ Ph	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1175	Me	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1176	CH ₂ OMe	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1177	CH ₂ OEt	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1178	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3,4-OCH ₂ O-Ph	O	
1-1179	H	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1180	CO ₂ Me	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1181	CO ₂ Et	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1182	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1183	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1184	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1185	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1186	CO ₂ Ph	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1187	Me	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1188	CH ₂ OMe	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1189	CH ₂ OEt	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1190	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3-EtO-Ph	O	
1-1191	H	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1192	CO ₂ Me	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1193	CO ₂ Et	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1194	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1195	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1196	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1197	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1198	CO ₂ Ph	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1199	Me	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1200	CH ₂ OMe	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1201	CH ₂ OEt	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	

【表1-32】
第1表(續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-1202	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1203	H	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1204	CO ₂ Me	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1205	CO ₂ Et	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1206	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1207	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1208	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1209	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1210	CO ₂ Ph	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1211	Me	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1212	CH ₂ OMe	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1213	CH ₂ OEt	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1214	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3- <i>i</i> -PrO-Ph	O	
1-1215	H	H	H	Me	3-CF ₃	O	1.4957(19)
1-1216	CO ₂ Me	H	H	Me	3-CF ₃	O	1.4580(20)
1-1217	CO ₂ Et	H	H	Me	3-CF ₃	O	1.4976(20)
1-1218	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1219	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1220	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1221	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1222	CO ₂ Ph	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1223	Me	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1224	CH ₂ OMe	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1225	CH ₂ OEt	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1226	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	3-CF ₃	O	
1-1227	H	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1228	CO ₂ Me	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1229	CO ₂ Et	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1230	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1231	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1232	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1233	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1234	CO ₂ Ph	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1235	Me	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1236	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1237	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1238	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	4-CF ₃	O	
1-1239	H	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	169.2-170.2
1-1240	CO ₂ Me	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	1.5145(22)

【表1-33】

第1表(續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-1241	CO ₂ Et	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	1.5068(21)
1-1242	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1243	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1244	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1245	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1246	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1247	Me	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1248	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1249	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1250	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,5-Cl ₂	O	
1-1251	H	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1252	CO ₂ Me	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1253	CO ₂ Et	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1254	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1255	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1256	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1257	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1258	CO ₂ Ph	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1259	Me	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1260	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1261	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1262	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	4-PhO-Ph	O	
1-1263	H	H	H	Me	4-Br-Ph	O	1.5323(19)
1-1264	CO ₂ Me	H	H	Me	4-Br-Ph	O	1.5195(22)
1-1265	CO ₂ Et	H	H	Me	4-Br-Ph	O	1.5222(22)
1-1266	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1267	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1268	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1269	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1270	CO ₂ Ph	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1271	Me	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1272	CH ₂ OMe	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1273	CH ₂ OEt	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1274	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	4-Br-Ph	O	
1-1275	H	H	H	Et	2-F-Ph	O	
1-1276	CO ₂ Me	H	H	Et	2-F-Ph	O	
1-1277	CO ₂ Et	H	H	Et	2-F-Ph	O	
1-1278	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	2-F-Ph	O	
1-1279	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	2-F-Ph	O	

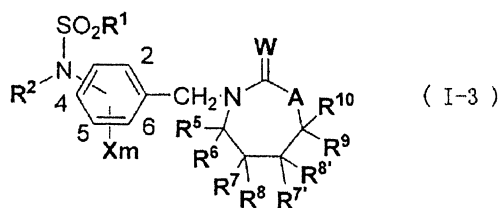
【表 1 - 3 4】
第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-1280	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	2-F-Ph	0	
1-1281	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	2-F-Ph	0	
1-1282	CO ₂ Ph	H	H	Et	2-F-Ph	0	
1-1283	Me	H	H	Et	2-F-Ph	0	
1-1284	CH ₂ OMe	H	H	Et	2-F-Ph	0	
1-1285	CH ₂ OEt	H	H	Et	2-F-Ph	0	
1-1286	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	2-F-Ph	0	
1-1287	H	H	H	Et	3-MeO-Ph	0	
1-1288	CO ₂ Me	H	H	Et	3-MeO-Ph	0	
1-1289	CO ₂ Et	H	H	Et	3-MeO-Ph	0	
1-1290	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Et	3-MeO-Ph	0	
1-1291	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Et	3-MeO-Ph	0	
1-1292	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Et	3-MeO-Ph	0	
1-1293	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Et	3-MeO-Ph	0	
1-1294	CO ₂ Ph	H	H	Et	3-MeO-Ph	0	
1-1295	Me	H	H	Et	3-MeO-Ph	0	
1-1296	CH ₂ OMe	H	H	Et	3-MeO-Ph	0	
1-1297	CH ₂ OEt	H	H	Et	3-MeO-Ph	0	
1-1298	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Et	3-MeO-Ph	0	
1-1299	H	H	H	Me	<i>c</i> -Hex	0	
1-1300	CO ₂ Me	H	H	Me	<i>c</i> -Hex	0	
1-1301	CO ₂ Et	H	H	Me	<i>c</i> -Hex	0	
1-1302	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	<i>c</i> -Hex	0	
1-1303	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Hex	0	
1-1304	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Hex	0	
1-1305	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	<i>c</i> -Hex	0	
1-1306	CO ₂ Ph	H	H	Me	<i>c</i> -Hex	0	
1-1307	Me	H	H	Me	<i>c</i> -Hex	0	
1-1308	CH ₂ OMe	H	H	Me	<i>c</i> -Hex	0	
1-1309	CH ₂ OEt	H	H	Me	<i>c</i> -Hex	0	
1-1310	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	<i>c</i> -Hex	0	
1-1311	H	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	0	
1-1312	CO ₂ Me	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	0	
1-1313	CO ₂ Et	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	0	
1-1314	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	0	
1-1315	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	0	
1-1316	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	0	
1-1317	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	0	
1-1318	CO ₂ Ph	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	0	

【表 1-35】
第 1 表 (續)

化合物編號	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
1-1319	Me	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	
1-1320	CH ₂ OMe	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	
1-1321	CH ₂ OEt	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	
1-1322	CH ₂ O <i>n</i> -Pr	H	H		(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂	O	
1-1323	H	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1324	CO ₂ Me	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1325	CO ₂ Et	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1326	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1327	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1328	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1329	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1330	CO ₂ Ph	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1331	Me	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1332	CH ₂ OMe	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1333	CH ₂ OEt	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	
1-1334	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	Me	2,6-Cl ₂ -3-F-Ph	O	

【表 2】
通式 (I-3)

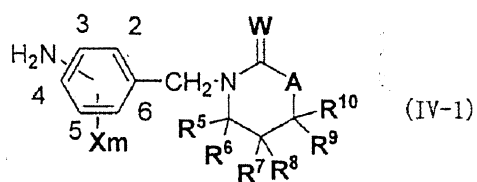


第2表 ($m=0$ 、 $A=O$ 、 $R^5=R^6=R^7=R^8=H$)

化合物 編號	取代 位置	R ¹	R ²	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
2-1	2	CF ₃	H	H	H	H	H	O	110.6
2-2	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	H	H	H	O	
2-3	2	CF ₃	CO ₂ Et	H	H	H	H	O	1.4977(27)
2-4	2	CF ₃	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	H	O	86.7
2-5	2	CF ₃	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	H	O	1.4935(26)
2-6	2	CF ₃	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	H	O	1.4928(26)
2-7	2	CF ₃	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	H	O	
2-8	2	CF ₃	Me	H	H	H	H	O	
2-9	2	CF ₃	CH ₂ OMe	H	H	H	H	O	
2-10	2	CF ₃	CH ₂ OEt	H	H	H	H	O	
2-11	2	CF ₃	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	H	O	
2-12	2	CF ₃	H	H	H	H	H	S	1.5204(26)
2-13	2	CF ₃	CO ₂ Me	H	H	H	H	S	
2-14	2	CF ₃	CO ₂ Et	H	H	H	H	S	49.7-52.8
2-15	2	CF ₃	CO ₂ <i>n</i> -Pr	H	H	H	H	S	
2-16	2	CF ₃	CO ₂ <i>n</i> -Bu	H	H	H	H	S	
2-17	2	CF ₃	CO ₂ <i>i</i> -Bu	H	H	H	H	S	59.3-62.8
2-18	2	CF ₃	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	H	H	H	H	S	
2-19	2	CF ₃	Me	H	H	H	H	S	
2-20	2	CF ₃	CH ₂ OMe	H	H	H	H	S	
2-21	2	CF ₃	CH ₂ OEt	H	H	H	H	S	
2-22	2	CF ₃	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	H	H	H	H	S	
2-23	2	CF ₃	H	Me	H	H	H	O	1.4945(26)
2-24	2	CF ₃	CO ₂ Me	Me	H	H	H	O	1.4965(25)
2-25	2	CF ₃	CO ₂ Et	Me	H	H	H	O	1.4909(25)
2-26	2	CF ₃	CO ₂ <i>n</i> -Pr	Me	H	H	H	O	
2-27	2	CF ₃	CO ₂ <i>n</i> -Bu	Me	H	H	H	O	1.4889(25)
2-28	2	CF ₃	CO ₂ <i>i</i> -Bu	Me	H	H	H	O	1.4898(25)
2-29	2	CF ₃	CO ₂ CH ₂ <i>t</i> -Bu	Me	H	H	H	O	
2-30	2	CF ₃	Me	Me	H	H	H	O	
2-31	2	CF ₃	CH ₂ OMe	Me	H	H	H	O	
2-32	2	CF ₃	CH ₂ OEt	Me	H	H	H	O	
2-33	2	CF ₃	CH ₂ O <i>i</i> -Pr	Me	H	H	H	O	
2-34	2	CF ₃	CO ₂ CH ₂ CCl ₃	Me	H	H	H	O	1.5041(25)

【表3-1】

通式 (IV-1)

第3表 (m=0、A=O、R⁵=R⁶=H)

化合物編號	取代位置	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
3-1	2	H	H	H	H	O	1.5489(22)
3-2	2	H	H	H	H	S	1.6278(24)
3-3	2	Me	Me	H	H	O	1.5509(23)
3-4	2	Me	Me	H	H	S	90.8-92.1
3-5	2	H	H	Me	Me	O	1.5402(22)
3-6	2	H	H	Me	Me	S	1.5815(22)
3-7	2	H	H	Me	Et	O	1.5476(22)
3-8	2	H	H	Me	CF ₃	O	1.5088(22)
3-9	2	H	H	Et	CF ₃	O	1.5069(22)
3-10	2	H	H	Et	Et	O	1.5365(22)
3-11	2	H	H	Et	Et	S	1.5743(23)
3-12	2	H	H	Me	<i>c</i> -Pr	O	1.5481(20)
3-13	2	H	H		(CH ₂) ₄	O	1.5612(24)
3-14	2	H	H	<i>c</i> -Pr	<i>c</i> -Pr	O	1.5475(27)
3-15	2	H	H	Me	Ph	O	1.5891(25)
3-16	2	H	H	Me	2-Cl-Ph	O	1.5732(26)
3-17	2	H	H	<i>c</i> -Pr	Ph	O	1.5853(27)
3-18	2	H	H	<i>c</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	1.5891(26)
3-19	2	H	H	<i>c</i> -Bu	Ph	O	1.5581(25)
3-20	2	H	H	Ph	Ph	O	61-65
3-21	2	H	H	CF ₃	Ph	O	1.5314(26)
3-22	2	H	H	H	Ph	O	1.5719(26)
3-23	2	H	H	H	2-F-Ph	O	1.5822(24)
3-24	2	Me	Me	H	Ph	O	1.5712(23)
3-25	2	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	O	1.5721(20)
3-26	2	H	H	H	2-Me-Ph	O	1.5929(22)
3-27	2	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	O	1.5535(21)
3-28	2	H	H	H	2-Cl-Ph	O	1.5892(23)
3-29	2	H	H	Et	Ph	O	1.5576(22)
3-30	2	H	H	CF ₃	CF ₃	O	1.4831(22)
3-31	2	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	154.2
3-32	2	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	1.5629(21)

【表 3-2】

第 3 表 (續)

化合物編號	取代位置	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
3-33	2	H	H	Me	1-Me-1- <i>o</i> -Pr	O	1.5531(20)
3-34	2	H	H	Me	<i>o</i> -Bu	O	123.5-126.1
3-35	2	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	1.4955(23)
3-36	2	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	1.5210(20)
3-37	2	H	H	Me	2-F-Ph	O	110.5
3-38	2	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	1.5295(26)
3-39	2	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	1.5520(26)
3-40	2	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	97
3-41	2	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	1.5878(23)
3-42	2	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	1.5258(26)
3-43	2	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	1.5273(26)
3-44	2	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	1.5744(26)
3-45	2	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	1.5200(25)
3-46	2	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	1.5752(24)
3-47	2	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	1.5192(25)
3-48	2	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	1.5960(24)
3-49	2	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	1.5296(26)
3-50	2	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	1.5754(26)
3-51	2	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	1.5252(25)
3-52	2	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	1.5132(25)
3-53	2	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	1.5269(26)
3-54	2	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	1.4971(25)
3-55	2	H	H	Me	2-Br-Ph	O	1.5705(26)
3-56	2	H	H	Et	4-F-Ph	O	1.5281(27)
3-57	2	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	1.5800(27)
3-58	2	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	1.5580(27)
3-59	2	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	1.5187(27)
3-60	2	H	H	Me	3-Me-Ph	O	1.5780(24)
3-61	2	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	1.5568(25)
3-62	2	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	112
3-63	2	H	H	Me	2-F-6-CF ₃ -Ph	O	1.5352(26)
3-64	2	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	1.5550(25)
3-65	2	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	1.5708(24)
3-66	2	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	1.5211(24)
3-67	2	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	1.5299(26)
3-68	2	H	H	Me	3-F-Ph	O	1.5486(25)
3-69	2	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	1.5363(25)
3-70	2	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	1.5728(24)

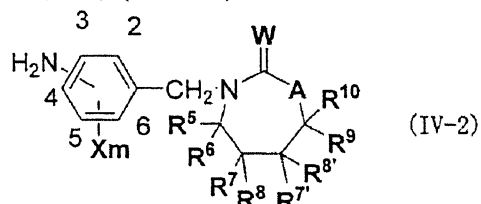
【表 3-3】
第 3 表 (續)

化合物編號	取代位置	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
3-71	2	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	1.5767(24)
3-72	2	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	1.5479(24)
3-73	2	H	H	Me	4-Me-Ph	O	138.9-140.2
3-74	2	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	1.5340(26)
3-75	2	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	1.5732(24)
3-76	2	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	1.5781(24)
3-77	2	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	1.5593(20)
3-78	2	H	H	Me	4-F-Ph	O	1.5620(21)
3-79	2	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	1.5730(26)
3-80	2	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	1.5800(27)
3-81	2	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	1.5710(19)
3-82	2	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	1.5652(19)
3-83	2	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	1.5724(20)
3-84	2	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	1.5732(24)
3-85	2	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	1.5728(24)
3-86	2	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	1.5550(25)
3-87	2	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	1.5708(24)
3-88	2	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	1.5568(25)
3-89	2	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	1.5580(27)
3-90	2	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	1.5862(22)
3-91	2	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	1.5279(23)

【0079】

【表 4】

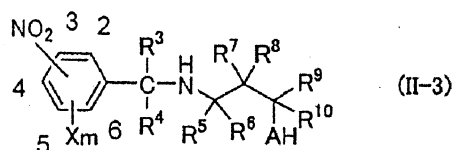
通式 (IV-2)

第 4 表 (m=0、A=O、R⁵=R⁶=R⁷=R⁸=H)

化合物編號	取代位置	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	W	物性
4-1	2	H	H	H	H	O	1.5480(22)
4-2	2	H	H	H	H	S	1.5979(26)
4-3	2	Me	H	H	H	O	1.5432(26)

【表5-1】

通式(II-3)

第5表 (m=0、A=O、R³=R⁴=R⁵=R⁶=H)

化合物編號	取代位置	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	A	物性
5-1	2	H	H	H	H	O	1.5489(24)
5-2	2	Me	Me	H	H	O	1.5265(23)
5-3	2	H	H	Me	Me	O	65.3-67.9
5-4	2	H	H	Me	Et	O	1.5392(23)
5-5	2	H	H	Me	CF ₃	O	1.4945(19)
5-6	2	H	H	Et	CF ₃	O	1.4992(22)
5-7	2	H	H	Et	Et	O	1.5245(20)
5-8	2	H	H	Me	<i>o</i> -Pr	O	1.5350(20)
5-9	2	H	H		(CH ₂) ₄	O	1.5416(23)
5-10	2	H	H	<i>o</i> -Pr	<i>o</i> -Pr	O	1.5369(27)
5-11	2	H	H	Me	Ph	O	1.5572(23)
5-12	2	H	H	Me	2-Cl-Ph	O	1.5749(25)
5-13	2	H	H	<i>o</i> -Pr	Ph	O	1.5604(26)
5-14	2	H	H	<i>o</i> -Pr	4-Cl-Ph	O	1.5571(25)
5-15	2	H	H	<i>o</i> -Bu	Ph	O	1.5603(26)
5-16	2	H	H	Ph	Ph	O	98.2-100.1
5-17	2	H	H	CF ₃	Ph	O	1.5416(26)
5-18	2	H	H	H	Ph	O	1.5537(25)
5-19	2	H	H	H	2-F-Ph	O	1.5625(26)
5-20	2	Me	Me	H	Ph	O	1.5468(25)
5-21	2	H	H	H	2,6-Cl ₂ -Ph	O	86.2
5-22	2	H	H	H	2-Me-Ph	O	1.5696(19)
5-23	2	H	H	H	2-CF ₃ -Ph	O	69.2-70.3
5-24	2	H	H	H	2-Cl-Ph	O	1.5714(17)
5-25	2	H	H	Et	Ph	O	1.5570(20)
5-26	2	H	H	Me	<i>t</i> -Bu	O	1.5325(17)
5-27	2	H	H	CF ₃	CF ₃	O	67.2
5-28	2	H	H	H	2,6-F ₂ -Ph	O	1.5606(18)
5-29	2	H	H	H	2,6-Me ₂ -Ph	O	108.3
5-30	2	H	H	Me	1-Me-1- <i>o</i> -Pr	O	1.5361(21)
5-31	2	H	H	Me	<i>o</i> -Bu	O	1.5398(25)
5-32	2	H	H	Me	2-CF ₃ -Ph	O	NMR
5-33	2	H	H	Et	<i>i</i> -Bu	O	1.5219(25)

【表5-2】
第5表(續)

化合物編號	取代位置	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	A	物性
5-34	2	H	H	Me	2-F-Ph	O	NMR
5-35	2	H	H	Et	<i>i</i> -Pr	O	1.5276(25)
5-36	2	H	H	Me	CH ₂ -2-F-Ph	O	
5-37	2	H	H	Me	4-Cl-Ph	O	NMR
5-38	2	H	H	Me	CH ₂ -2,6-Cl ₂ -Ph	O	
5-39	2	H	H	Et	<i>n</i> -Pr	O	1.5204(25)
5-40	2	H	H	Me	<i>neo</i> -Pen	O	1.5185(26)
5-41	2	H	H	Me	CH ₂ -2-Cl-Ph	O	
5-42	2	H	H	<i>n</i> -Pr	<i>n</i> -Pr	O	1.5145(24)
5-43	2	H	H	Me	CH ₂ -4-Cl-Ph	O	
5-44	2	H	H	<i>i</i> -Bu	<i>i</i> -Bu	O	1.5106(26)
5-45	2	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-Ph	O	
5-46	2	H	H	Me	CH ₂ -3-CF ₃ -Ph	O	
5-47	2	H	H	Me	C(CH ₂ CH ₂)-3-Cl-Ph	O	
5-48	2	H	H	Me	<i>n</i> -Bu	O	1.5161(24)
5-49	2	H	H	Et	<i>n</i> -Bu	O	1.5182(25)
5-50	2	H	H	Me	<i>n</i> -Pr	O	1.5255(26)
5-51	2	H	H	Me	CH ₂ CF ₃	O	1.4995(28)
5-52	2	H	H	Me	2-Br-Ph	O	NMR
5-53	2	H	H	Et	4-F-Ph	O	1.5422(26)
5-54	2	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	1.5542(27)
5-55	2	H	H	<i>n</i> -Bu	<i>n</i> -Bu	O	1.5010(27)
5-56	2	H	H	Me	3-Me-Ph	O	1.5491(25)
5-57	2	H	H	Me	3,4-F ₂ -Ph	O	1.5382(24)
5-58	2	H	H	Me	<i>i</i> -Pr	O	1.5220(25)
5-59	2	H	H	Me	<i>i</i> -Bu	O	1.5223(25)
5-60	2	H	H	Me	3-F-Ph	O	1.5442(25)
5-61	2	H	H	Me	2,4-F ₂ -Ph	O	1.5289(25)
5-62	2	H	H	Me	4-Ph-Ph	O	1.5735(23)
5-63	2	H	H	Me	3,5-F ₂ -Ph	O	1.5358(26)
5-64	2	H	H	Me	4-Me-Ph	O	1.5525(23)
5-65	2	H	H	Me	CH ₂ OMe	O	1.5225(25)
5-66	2	H	H	Me	2-MeO-Ph	O	1.5742(24)
5-67	2	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -Ph	O	1.5635(21)
5-68	2	H	H	Me	4-F-Ph	O	1.5421(20)
5-69	2	H	H	Me	2,4-Cl ₂ -5-F-Ph	O	1.5600(23)
5-70	2	H	H	Me	3-MeO-Ph	O	1.5746(26)
5-71	2	H	H	Me	4-MeO-Ph	O	1.5636(22)

【表 5 - 3】

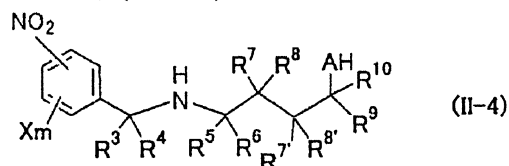
第 5 表 (續)

化合物編號	取代位置	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	A	物性
5-72	2	H	H	Me	2-F-4-MeO-Ph	O	1.5339(22)
5-73	2	H	H	Me	3-F-4-MeO-Ph	O	1.5350(22)
5-74	2	H	H	Me	CH ₂ -4-Me-Ph	O	1.5502(26)
5-75	2	H	H	Me	CH ₂ -4-MeO-Ph	O	1.5558(26)
5-76	2	H	H	Me	CH ₂ -3,4-F ₂ -Ph	O	1.5396(24)
5-77	2	H	H	Me	CH ₂ -3-Cl-4-F-Ph	O	1.5508(26)
5-78	2	H	H	Me	CH ₂ -3-F-Ph	O	1.5449(26)
5-79	2	H	H	Me	CH ₂ -4-F-Ph	O	1.5468(26)
5-80	2	H	H	Me	2,4-Me ₂ -Ph	O	1.5556(21)
5-81	2	H	H	Me	4-Br-Ph	O	1.5615(19)
5-82	2	H	H	Me	CH ₂ C(Me) ₂ OMe	O	1.5241(20)

【0083】

【表 6】

通式 (II-4)

第 6 表 (m=0、A=O、R³=R⁴=R⁵=R⁶=R⁷=R⁸=H)

化合物編號	取代位置	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	物性
6-1	2	H	H	H	H	1.5431(24)
6-2	2	Me	H	H	H	1.5372(24)

【表 7】

第 7 表

化合物編號	¹ H-NMR(CDCl ₃ /TMS, δ 值ppm)
5-32	7.96(1H, dd), 7.77(1H, d), 7.72(1H, d), 7.57(1H, ddd), 7.51(1H, t), 7.46(1H, dd), 7.42(1H, ddd), 7.34(1H, t), 3.93(1H, d), 3.82(1H, d), 2.95(1H, ddd), 2.59(1H, ddd), 2.35(1H, ddd), 2.02(1H, ddd), 1.60(3H, s)
5-34	7.98(1H, d), 7.77(1H, ddd), 7.58(1H, ddd), 7.45(1H, d), 7.43(1H, ddd), 7.22(1H, dd), 7.15(1H, ddd), 6.99(1H, dd), 3.92(1H, d), 3.83(1H, d), 2.89(1H, ddd), 2.43(1H, ddd), 2.28(1H, ddd), 2.01(1H, ddd), 1.56(3H, s)
5-37	7.98(1H, d), 7.58(1H, dd), 7.45(2H, m), 7.38(1H, d), 7.29(1H, d), 3.94(1H, d), 3.85(1H, d), 2.86(1H, ddd), 2.50(1H, ddd), 2.20-1.91(2H, m), 1.48(3H, s)
5-52	8.02(1H, dd), 7.98(1H, dd), 7.58(1H, ddd), 7.56(1H, dd), 7.47-7.40(2H, m), 7.33(1H, ddd), 7.09(1H, ddd), 3.90(1H, d), 3.81(1H, d), 2.92-2.82(1H, m), 2.38(1H, m), 1.98(1H, m), 1.68(3H, s)

本發明的鹵烷基砒苯胺衍生物或其鹽類，係有益於去除例如稗子（水稻科 1 年生草，水田雜草）、陌上菜（北玄參科 1 年生草，水田雜草）、鴨舌草（水錦葵科 1 年生草，水田雜草）、水錦葵（水錦葵科 1 年生草，水田雜草）、多花水菟菜（千屈菜科 1 年生草，水田雜草）、異型莎草（莎草科 1 年生草，水田雜草）、牛毛毡（莎草科多年生草，發生於溼地、水路、水田，水田的多年生雜草）、野慈菇（澤瀉科，發生於水田、溼地、水溝之多年生雜草）、矮慈菇（澤瀉科，發生於水田、溼地、水溝之多年生雜草）、螢藺（莎草科多年生草，發生於水田、溼地、水溝）、馬蹄（莎草科多年生草，發生於水田、溼地、水溝）、看麥娘（稻科 2 年生草，發生於水田作物、低溼地）、野燕麥（稻科 2 年生草，發生於平地、荒地、田地）、艾蒿（菊科多年生草，發生於山野、田地）、馬唐（稻科 1 年生草，田地、樹園地雜草）、羊蹄（蓼科多年生草，發生於田地、道路旁）、碎米莎草（莎草科 1 年生草，田地雜草）、綠菟（菟科 1 年生草，發生於空地、道路旁、田地）、蒼耳（菊科 1 年生草，田地雜草）、苘麻（錦葵科 1 年生草，田地雜草）、曼陀羅（茄科 1 年生草，田地雜草）、苦賈（玄參科 2 年生草，田地雜草）或豬殃殃（茜草科 2 年生草，田地、樹園地雜草）等發生於水田、田地、樹園地、溼地等的 1 年生、2 年生及多年生雜草。對去除水田的雜草特別有效，因對稻-水田雜草間的選擇性範圍廣，故具有使用為水田用除草劑之優異性能。

本發明的鹵烷基砒苯胺衍生物或其鹽類，係對發芽前及了發芽後的雜草具優異的除草效果，藉由在有用植物的種植預定地預先進行處理，或種植有用植物後（包括有用植物定植於樹園時）雜草的發生期開始至生育期進行處理，可有效地發揮本發明的除草劑組成物之特別生理活性。惟本發明的除草劑組成物並非只使用於該樣態，例如本發明除草劑組成物不只可使用為水田用除草劑，亦可使用為一般雜草的除草劑，例如亦可使用於收穫後、休耕地、田埂、農業道路、水路、牧草地、墓地、公園、道路、運動場、建築物週邊空地、開墾地、道路端或森林等一般雜草之去除。此時，至雜草的發生始期為止之處理乃符合經濟性且最有效益，惟不一定受限於此，亦可防治生育期的雜草。

本發明的鹵烷基砒苯胺衍生物或其鹽類使用為除草劑時，宜依據農藥製劑上的常法，製劑成易於使用之形狀而使用。亦即，使本發明的有效成分即通式（I）表示的鹵烷基砒苯胺衍生物或其鹽類，依需求和輔助劑一起，以適當的比例摻合而溶解、分離、懸浮、混合、含浸、吸附或附著於適當的惰性載體，製劑成適當的劑型，例如懸浮劑、乳懸浮劑、乳劑、液劑、可濕性粉劑、顆粒可濕性粉劑、粒劑、粉劑、錠劑、巨型劑或包劑等而使用。

可使用於本發明的惰性載體係可為固體或液體，可成為固體的載體之材料，例如植物質粉末類（例如大豆粉、

穀物粉、木粉、樹皮粉、鋸粉、菸草莖粉、核桃殼粉、麩皮、纖維素粉末、植物經過萃取後的殘渣等）、粉碎合成樹脂等合成聚合物、黏土類（例如陶土、膨土、酸性白土等）、滑石類（例如滑石、葉蠟石等）、二氧化矽類（例如矽藻土、矽砂、雲母、白碳（又稱為含水微粉矽、含水矽酸之合成高分散矽酸，依製品亦有含矽酸鈣為主成分者。））、活性碳、天然礦物質類（例如硫粉末、浮石、綠坡縷石及沸石等）、燒結矽藻土、磚粉碎物、飛灰、砂、塑膠載體等（例如聚乙烯、聚丙烯、聚偏二氯乙烯等）、碳酸鈣、磷酸鈣等無機礦物性粉末、硫酸銨、磷酸銨、硝酸銨、尿素、鹽酸銨等化學肥料或堆肥等，這些係可單獨使用或以二種以上的混合物形式而使用。

可成為液體的載體之材料，除了本身具有溶劑能之物質外，亦可選自即使無溶劑能而藉由輔助劑可使有效成分化合物分散者，其代表例係如下述載體，惟這些可單獨使用或以二種以上的混合物形式而使用，例如水、醇類（例如甲醇、乙醇、異丙醇、丁醇、乙二醇等）、酮類（例如丙酮、甲基乙酮、甲基異丁酮、二異丁酮、環己酮等）、醚類（例如乙醚、二噁烷、溶纖劑、二丙醚、四氫呋喃等）、脂肪族烴類（例如煤油、礦油等）、芳香族烴類（例如苯、甲苯、二甲苯、溶劑油、烷萘等）、鹵化烴類（例如二氯乙烷、三氯甲烷、四氯化碳等）、酯類（例如醋酸乙酯、二異丙基對苯二甲酸酯、二丁基對苯二甲酸酯、二辛基對

苯二甲酸酯等)、醯胺類(例如二甲基甲醯胺、二乙基甲醯胺、二甲基乙醯胺等)、腈類(例如乙腈等)或二甲基亞砷類等。

其他輔助劑係如下列所舉的代表之輔助劑，這些輔助劑係可依據目的而使用，單獨使用或併用二種以上的輔助劑，亦可完全不使用輔助劑。為使有效成分化合物乳化、分散、可溶化及/或濕潤，可使用界面活性劑，例如聚環氧乙烷烷基醚、聚環氧乙烷烷基芳基醚、聚環氧乙烷高級脂肪酸酯、聚環氧乙烷樹脂酸酯、聚環氧乙烷山梨糖醇酐單月桂酸酯、聚環氧乙烷山梨糖醇酐單油酸酯、烷基芳基磺酸鹽、萘磺酸縮合物、木質磺酸鹽或高級醇硫酸酯等界面活性劑。

又，以有效成分化合物的分散安定化、黏附及/或鍵結為目的，亦可使用其次所舉之輔助劑，例如酪蛋白、明膠、澱粉、甲基纖維素、羧甲基纖維素、阿拉伯膠、聚乙烯醇、松根油、糠油、皂土或木質磺酸鹽等輔助劑。為改良固體製品的流動性，亦可使用其次所舉之輔助劑，例如蠟、硬脂酸鹽或磷酸烷基酯等輔助劑。懸浮性製品的散凝劑，係可使用例如萘磺酸縮合物或縮合磷酸鹽等輔助劑。消泡劑係可使用例如矽油等輔助劑。

相對於本發明的整體除草劑，有效成分化合物的摻合比例，係無特別的限制，可依需求加減，通常為 0.01~90 質量% 左右，例如粉劑或粒劑時，宜為 0.1~50 質量% 左右，尤宜 0.5~10 質量% 左右，乳劑、可濕性粉劑或顆粒可濕性

粉劑時，宜為 0.1~90 質量% 左右，尤宜 0.5~50 質量% 左右。

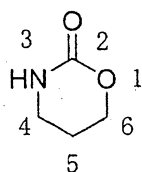
本發明的除草劑為枯殺各種雜草或抑制其生長，直接或以水等適當地稀釋，或以懸浮形態殺草，或將抑制生長的有效量處理於該雜草或不期待該雜草發生、成長之場所。例如若為田地或非農耕地時，可處理於莖葉或土壤，若為水田時，則可處理於水田水。

本發明的除草劑之用量係依據各種因素，例如目的、對象雜草、作物的生長狀況、發生雜草的難易度、天候、環境條件、劑型、施用方法、施用場所、施用時期等而變動，惟每 1 公頃地中，有效成分化合物的用量係可因應目的而適當地選自 0.1g~10kg 之範圍。

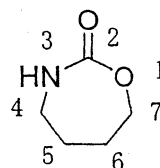
以本發明的鹵烷基砒苯胺衍生物或其鹽類為有效成分之除草劑，為達擴大殺草範圍、增加除草活性等目的，亦可與其他具除草活性的化合物混合而使用。且本發明的除草劑組成物亦可與殺蟲劑或殺菌劑混合而使用。

其次，舉出實例、製劑例及試驗例具體地說明本發明，惟本發明不受限於此。

又，實例中 [1,3]-氮氧吡(oxazinane)-2-酮及 [1,3]-氮氧哌(oxazepane)-2-酮係表示為以下的結構。



[1,3]-氮氧吡-2-酮



[1,3]-氮氧哌-2-酮

實例 1 3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡-2-酮(化合物 No.1-1)之製造

1-1) 3-(2-硝基苄)-[1,3]-氮氧吡-2-酮之製造

將 3-(2-硝基苄基胺)-1-丙醇(1.03g、4.90 毫莫耳)溶解於三氯甲烷(20ml)，使反應溶液冷卻至 0℃。其次添加三乙胺(1.98g、19.6 毫莫耳)、三光氣(0.58g、1.95 毫莫耳)，於該溫度下攪拌 1.5 小時。將水添加於反應液並以醋酸乙酯萃取，以飽和食鹽水洗淨後，利用硫酸酐鈉進行乾燥，於減壓下蒸餾去除溶劑。於矽膠管柱層析(己烷：醋酸乙酯 = 1：4)中精製殘渣，製得 3-(2-硝基苄)-[1,3]-氮氧吡-2-酮(0.29g)。

收率：25%

物性：mp.137.8℃

1-2) 3-(2-胺基苄)-[1,3]-氮氧吡-2-酮(化合物 No. 3-1)之製造

將 3-(2-硝基苄)-[1,3]-氮氧吡-2-酮(0.24g、1.02 毫莫耳)、鐵粉末(0.28g、5.02 毫莫耳)、氯化銨(0.03g、0.56 毫莫耳)溶解於乙醇(10ml)和水(5ml)，加熱回流 1 小時。冷卻至室溫後，使反應液進行吸濾，以醋酸乙酯萃取。以飽和食鹽水洗淨有機層後，利用硫酸酐鈉進行乾燥，於減壓下蒸餾去除溶劑而製得 3-(2-胺基苄)-[1,3]-氮氧吡-2-酮(0.20g)。

收率：95%

物性： n_D 1.5489 (22°C)

1-3) 3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (化合物 No.1-1) 之製造

將 3-(2-胺基苄)-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (0.17g、0.83 毫莫耳) 和三乙胺 (0.09g、0.89 毫莫耳) 溶解於三氯甲烷 (10ml)，使反應溶液冷卻至 -10°C。緩緩地滴入三氟甲磺酸酐 (0.24g、0.85 毫莫耳)，於該溫度下攪拌 30 分鐘。將反應液注入冰水，以 0.5N 鹽酸水將 pH 由 3 調整至 4，使用醋酸乙酯萃取。以硫酸酐鈉使有機層乾燥後，於減壓下蒸餾去除溶劑。於矽膠管柱層析 (己烷：醋酸乙酯 = 1：4) 中精製殘渣，製得 3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (0.20g)。

收率：71%

物性： n_D 1.4952 (22°C)

實例 2 3-{2-[N-(丙氧羰基)-N-(三氟甲磺醯)胺基]苄基}-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (化合物 No.1-4) 之製造

將 3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (0.13g、0.38 毫莫耳) 和碳酸氫鈉 (0.06g、0.71 毫莫耳) 懸浮於乙腈 (15ml)，添加氯甲酸丙酯 (0.09g、0.77 毫莫耳) 並加熱回流 6 小時。冷卻至室溫後，將水加入反應液，以醋酸乙酯萃取。以飽和食鹽水洗淨有機層後，利用硫酸酐鈉進行乾燥並於減壓下蒸餾去除溶劑。於矽膠管柱層析 (己烷：醋酸乙酯 = 1：4) 中精製殘渣，製得 3-{2-[N-(丙

氧羰基)-N-(三氟甲磺醯)胺基]苄基]-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (0.11g)。

收率：68%

物性： n_D 1.4977 (24°C)

實例 3 6-苄基-3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (化合物 No.1-239) 之製造

3-1) 3-(2-硝基苄)-6-苄基-[1,3]-氮氧吡-2-酮之製造

將 3-(2-硝基苄基胺)-1-苄基丙醇 (3.00g、10.5 毫莫耳)、三乙胺 (4.24g、42.0 毫莫耳) 溶解於甲苯 (50ml)。於冰冷下，緩緩地滴入將三光氣 (1.24g、4.19 毫莫耳) 溶解於甲苯 (5ml) 之溶液，於室溫下攪拌 1 小時後，加熱回流 6 小時。冷卻後，將反應液注入水中並以醋酸乙酯萃取。以 0.1N 鹽酸水洗淨有機層後，利用硫酸酐鈉進行乾燥並於減壓下蒸餾去除溶劑。藉由以醚-醋酸乙酯 (1:2) 混合液來洗淨，而製得 3-(2-硝基苄)-6-苄基-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (1.70g)。

收率：52%

物性：mp. 117.8°C

3-2) 3-(2-胺基苄)-6-苄基-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (化合物 No. 3-22) 之製造

將 3-(2-硝基苄)-6-苄基-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (1.59g、5.10 毫莫耳)、鐵粉末 (1.42g、25.4 毫莫耳)、氯化銨 (0.14g、2.62 毫莫耳) 溶解於乙醇 (30ml) 和水 (15ml)，加熱回

流 1.5 小時。冷卻至室溫後，使反應液進行吸濾，以醋酸乙酯萃取。以飽和食鹽水洗淨有機層後，利用硫酸酐鈉進行乾燥，於減壓下蒸餾去除溶劑，而製得 3-(2-氨基苄)-6-苯基-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (1.43g)。

收率：99%

物性： n_D 1.5719 (26°C)

3-3) 6-苯基-3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (化合物 No.1-239) 之製造

將 3-(2-氨基苄)-6-苯基-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (1.33g、4.72 毫莫耳) 和三乙胺 (0.50g、4.95 毫莫耳) 溶解於三氯甲烷 (20ml)，使反應溶液冷卻至 -10°C。緩緩地滴入三氟甲磺酸酐 (1.40g、4.96 毫莫耳)，於該溫度下攪拌 2 小時。將反應液注入冰水，以 0.5N 鹽酸水將 pH 由 3 調整至 4，使用醋酸乙酯萃取。以硫酸酐鈉使有機層乾燥後，於減壓下蒸餾去除溶劑。於矽膠管柱層析 (己烷：醋酸乙酯 = 2:1) 中精製殘渣，製得 6-苯基-3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (1.70g)。

收率：87%

物性：mp. 152.0°C

實例 4 6-苯基-3-{2-[N-(乙氧甲基)-N-(三氟甲磺醯)氨基]苄基}-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (化合物 No.1-248) 之製造

將 6-苯基-3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡

-2-酮 (0.20g、0.48 毫莫耳) 和碳酸氫鈉 (0.08g、0.85 毫莫耳) 懸浮於乙腈 (10ml)，添加氯甲酸乙醚 (0.07g、0.83 毫莫耳) 並加熱回流 3 小時。冷卻至室溫後，將水加入反應液，以醋酸乙酯萃取。以飽和食鹽水洗淨有機層後，利用硫酸酐鈉進行乾燥並於減壓下蒸餾去除溶劑。於矽膠管柱層析 (己烷：醋酸乙酯 = 2：1) 中精製殘渣，製得 6-苯基-3-{2-[N-(乙氧甲基)-N-(三氟甲磺醯)胺基]苄基}-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (0.17g)。

收率：75%

物性：mp. 115.6°C

實例 5 6-甲基-3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (化合物 No.2-23) 之製造

5-1) 6-甲基-3-(2-硝基苄)-[1,3]-氮氧吡-2-酮之製造

將 2-甲基-4-(2-硝基苄基胺)丁醇 (5.00g、21.0 毫莫耳)、三乙胺 (8.49g、84.1 毫莫耳) 溶解於甲苯 (50ml)。於冰冷下，緩緩地滴入將三光氣 (2.50g、8.42 毫莫耳) 溶解於甲苯 (10ml) 之溶液，於室溫下攪拌 1 小時後，加熱回流 6 小時。冷卻後，將反應液注入水中並以醋酸乙酯萃取。以 0.1N 鹽酸水洗淨有機層後，利用硫酸酐鈉進行乾燥並於減壓下蒸餾去除溶劑。於矽膠管柱層析 (己烷：醋酸乙酯 = 2：1) 中精製殘渣，製得 6-甲基-3-(2-硝基苄)-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (2.00g)。

收率：36%

物性： n_D 1.5392 (26°C)

5-2) 3-(2-胺基苄)-6-甲基-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (化合物 No. 4-3) 之製造

將 6-甲基-3-(2-硝基苄)-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (1.91g、7.23 毫莫耳)、鐵粉末 (2.02g、36.2 毫莫耳)、氯化銨 (0.19g、3.55 毫莫耳) 溶解於乙醇 (30ml) 和水 (15ml)，加熱回流 1 小時。冷卻至室溫後，使反應液進行吸濾，以醋酸乙酯萃取。以飽和食鹽水洗淨有機層後，利用硫酸銖鈉進行乾燥，於減壓下蒸餾去除溶劑而製得 3-(2-胺基苄)-6-甲基-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (1.02g)。

收率：60%

物性： n_D 1.5432 (26°C)

5-3) 6-甲基-3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (化合物 No.2-23) 之製造

將 3-(2-胺基苄)-6-甲基-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (0.95g、4.06 毫莫耳) 和三乙胺 (0.43g、4.26 毫莫耳) 溶解於三氯甲烷 (25ml)，使反應溶液冷卻至 -10°C。緩緩地滴入三氟甲磺酸酐 (1.20g、4.26 毫莫耳)，於該溫度下攪拌 2 小時。將反應液注入冰水，以 0.5N 鹽酸水調整 pH 由 3 至 4，使用醋酸乙酯萃取。以硫酸銖鈉使有機層乾燥後，於減壓下蒸餾去除溶劑。於矽膠管柱層析 (己烷：醋酸乙酯 = 2:1) 中精製殘渣，製得 6-甲基-3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (1.10g)。

收率：74%

物性： n_D 1.4945 (26°C)

實例 6 3-{2-[N-(異丁氧羰基)-N-(三氟甲磺醯)胺基]苄基}-6-甲基-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (化合物 No.2-28) 之製造

將 6-甲基-3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (0.15g、0.41 毫莫耳) 和碳酸氫鈉 (0.06g、0.71 毫莫耳) 懸浮於乙腈 (10ml)，添加氯甲酸異丁酯 (0.10g、0.73 毫莫耳) 並加熱回流 3 小時。冷卻至室溫後，將水加入反應液，以醋酸乙酯萃取。以飽和食鹽水洗淨醋酸乙酯層後，利用硫酸酐鈉進行乾燥並於減壓下蒸餾去除溶劑。於矽膠管柱層析 (己烷：醋酸乙酯 = 3：1) 中精製殘渣，製得 3-{2-[N-(異丁氧羰基)-N-(三氟甲磺醯)胺基]苄基}-6-甲基-[1,3]-氮氧吡-2-酮 (0.10g)。

收率：52%

物性： n_D 1.4898 (26°C)

實例 7 5,5-二甲基-3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡-2-硫 (化合物 No.1-34) 之製造

7-1) 5,5-二甲基-3-(2-硝基苄)-[1,3]-氮氧吡-2-硫之製造

將 2,2-二甲基-3-(2-硝基苄基胺)-1-丙醇 (1.07g、4.50 毫莫耳) 溶解於甲苯 (三氯甲烷 20ml)，使反應溶液冷卻至 0°C。其次添加三乙胺 (1.82g、18.0 毫莫耳)、硫光氣

(0.52g、4.50 毫莫耳) ，於該溫度攪拌 2 小時更於室溫攪拌 1 小時。將水加入反應液並於室溫攪拌 1 小時後，以醋酸乙酯萃取，再以飽和食鹽水洗淨有機層後，利用硫酸酞鈉進行乾燥並蒸餾去除溶劑。於矽膠管柱層析 (己烷 : 醋酸乙酯 = 1 : 1) 中精製殘渣，製得 5,5-二甲基-3-(2-硝基苄)-[1,3]-氮氧吡-2-硫 (1.12g) 。

收率 : 89%

物性 : n_D 1.5759 (21°C)

7-2) 3-(2-胺基苄)-5,5-二甲基-[1,3]-氮氧吡-2-硫 (化合物 No. 3-4) 之製造

將 5,5-二甲基-3-(2-硝基苄)-[1,3]-氮氧吡-2-硫 (1.06g、3.79 毫莫耳) 、鐵粉末 (1.06g、19.0 毫莫耳) 、氯化銨 (0.10g、1.87 毫莫耳) 溶解於乙醇 (20ml) 和水 (10ml) ，加熱回流 1 小時。冷卻至室溫後，使反應液進行吸濾，以醋酸乙酯萃取。以飽和食鹽水洗淨有機層後，利用硫酸酞鈉進行乾燥，於減壓下蒸餾去除溶劑而製得 3-(2-胺基苄)-5,5-二甲基-[1,3]-氮氧吡-2-硫 (0.60g) 。

收率 : 63%

物性 : 熔點 90.8 – 92.1°C

7-3) 5,5-二甲基-3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡-2-硫 (化合物 No.1-34) 之製造

將 3-(2-胺基苄)-5,5-二甲基-[1,3]-氮氧吡-2-硫 (0.54g、2.16 毫莫耳) 和三乙胺 (0.23g、2.28 毫莫耳) 溶

解於三氟甲烷（15ml），使反應溶液冷卻至 -10°C 。緩緩地滴入三氟甲磺酸酐（0.640g、2.28毫莫耳），於該溫度下攪拌1小時。於反應液中加入稀鹽酸並以醋酸乙酯萃取。以硫酸酐鈉使有機層乾燥後，於減壓下蒸餾去除溶劑。於矽膠管柱層析（己烷：醋酸乙酯=2：1）中精製殘渣，製得5,5-二甲基-3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡啶-2-硫（0.57g）。

收率：69%

物性：熔點 129.9°C

實例 8 5,5-二甲基-3-{2-[N-(甲氧羰基)-N-(三氟甲磺醯)胺基]苄基}-[1,3]-氮氧吡啶-2-硫（化合物 No.1-35）之製造

將5,5-二甲基-3-[2-(三氟甲磺醯胺)苄基]-[1,3]-氮氧吡啶-2-硫（0.15g、0.39毫莫耳）和碳酸氫鈉（0.05g、0.60毫莫耳）懸浮於乙腈（10ml），添加氯甲酸甲酯（0.06g、0.60毫莫耳）並加熱回流3小時。冷卻至室溫後，將水加入反應液，以醋酸乙酯萃取。以硫酸酐鈉使有機層乾燥後，於減壓下蒸餾去除溶劑。於矽膠管柱層析（己烷：醋酸乙酯=1：1）中精製殘渣，製得5,5-二甲基-3-{2-[N-(甲氧羰基)-N-(三氟甲磺醯)胺基]苄基}-[1,3]-氮氧吡啶-2-硫（0.08g）。

收率：47%

物性： $n_D 1.5295$ （ 26°C ）

參考例 1 3- (2-硝基苄基胺) -丙醇之製造

將 3-胺基丙醇 (3.94g、52.5 毫莫耳)、三乙胺 (1.77g、17.5 毫莫耳) 溶解於四氫呋喃 (30ml)，於室溫下添加 2-硝基苄氯化物 (3.00g、17.5 毫莫耳)。加熱回流 7 小時後待其冷卻，將反應液注入 1N 鹽酸水中，以醚萃取。以飽和碳酸氫鈉水溶液將水層調整為 pH9 後，以醋酸乙酯萃取。以飽和食鹽水洗淨有機層後，利用硫酸酐鈉進行乾燥，於減壓下蒸餾去除溶劑而製得 3- (2-硝基苄基胺) -丙醇 (1.22g)。

收率：33%

物性： n_D 1.5489 (24°C)

參考例 2 3- (2-硝基苄基胺) -1-苯基丙醇之製造

2-1) 3-羥基 -N- (2-硝基苄) -3-苯基丙酸醯胺之製造

將 2-硝基苄基胺 鹽酸鹽 (2.27g、12.0 毫莫耳)、3-羥基 -3-苯基丙酸 (2.00g、12.0 毫莫耳)、三乙胺 (1.34g、13.3 毫莫耳) 添加於四氫呋喃 (50ml)，使反應液冰冷。於冰冷下添加 4- (4,6-二甲氧基 -1,3,5-三吡 -2-基) -4-甲基嗎啉氯化物 (3.33g、12.0 毫莫耳)，於室溫下攪拌 5 小時。將反應液注入稀鹽酸水中，以醋酸乙酯萃取。以飽和食鹽水洗淨有機層後，利用硫酸酐鈉進行乾燥並於減壓下蒸餾去除溶劑。以己烷 - 醚 (2:1) 的混合物洗淨收得的粗結晶，製得 3-羥基 -N- (2-硝基苄) -3-苯基丙酸醯胺 (3.32g)。

收率：92%

物性：熔點 145.1°C

2-2) 3-(2-硝基苄基胺)-1-苯基丙醇之製造

將 3-羥基-N-(2-硝基苄)-3-苯基丙酸醯胺 (3.19g、10.6 毫莫耳) 溶解於四氫呋喃 (50ml)，於冰冷下滴入四氫呋喃-硼烷·四氫呋喃溶液 (27.0ml、27.0 毫莫耳)。滴入結束後，使反應液恢復至室溫並攪拌 1 小時後，加熱回流 6 小時，待其冷卻。於冰冷下滴入甲醇 (30ml)，加熱回流 30 分鐘。待其冷卻後，蒸餾去除溶劑並加入 0.5N 鹽酸水 (30ml)。以二乙醚萃取，以飽和碳酸氫鈉水溶液將水層調整為 pH8，以醋酸乙酯萃取。利用硫酸鈣使有機層乾燥，於減壓下蒸餾去除溶劑而製得 3-(2-硝基苄基胺)-1-苯基丙醇 (3.00g)。

收率：99%

物性： n_D 1.5537 (25°C)

參考例 3 2-甲基-4-(2-硝基苄基胺)丁醇之製造

將 2-硝基苯甲醛 (7.33g、48.5 毫莫耳) 和 4-胺基-2-甲基丁醇 (5.00g、48.5 毫莫耳) 溶解於甲苯 (50ml)，增添迪安·司達克 (Dean·Stark) 脫水管，加熱回流 2 小時。待其冷卻後，於減壓下蒸餾去除溶劑。將製得的濃縮物溶解於甲醇 (100ml)，於冰冷下加入硼氫化鈉 (2.75g、72.8 毫莫耳)，於相同溫度攪拌 2 小時。更於室溫攪拌 2 小時後，於反應液中添加 1N 鹽酸水，調整 pH 為 4，於減壓下蒸餾去除溶劑。添加水 (30ml) 以溶解濃縮物，以醋酸乙

酯萃取後，添加飽和碳酸氫鈉水溶液，調整 pH 為 8，以醋酸乙酯萃取。利用硫酸銓鈉使有機層乾燥，於減壓下蒸餾去除溶劑而製得 2-甲基-4-(2-硝基苄基胺)丁醇(11.12g)。

收率：96%

物性： n_D 1.5372 (24°C)

以下所示係本發明的代表性之製劑例及試驗例，惟本發明不受限於此。又製劑例中，「份」係表示為質量份。

製劑例 1 乳劑

本發明化合物	10 份
二甲苯	70 份
N-甲基吡咯烷酮	10 份
聚環氧乙烷壬基苯基醚和 烷基苯磺酸鈣之混合物	10 份

均勻地混合溶解上述成分以作成乳劑。

製劑例 2 粉劑

本發明化合物	3 份
黏土粉末	82 份
矽藻土粉末	15 份

均勻地混合粉碎上述成分以作成粉劑。

製劑例 3 粒劑

本發明化合物	5 份
皂土和黏土的混合粉末	90 份
木質磺酸鈣	5 份

均勻地混合上述成分，加入適量的水捏合，並造粒、乾燥以作成粒劑。

製劑例 4 水和劑

本發明化合物	20 份
陶土和合成高分散矽酸	75 份
聚環氧乙烷壬基苯基醚和	
烷基苯磺酸鈣之混合物	5 份

均勻地混合粉碎上述成分以作成水和劑。

試驗例 1 對發芽前 (pre) 的水田雜草之除草效果試驗

將土壤 (培養土) 填充於 75cm^2 的塑膠盆，將水田雜草螢蘭的種子播於其中，以 75cm^3 的已混合陌上菜的種子之土壤覆土後，浸水成水深 5cm 之狀態。次日，使用水來稀釋以依據製劑例 1 至 4 調製成的本發明化合物為有效成份的藥劑之規定有效藥量 (有效成分為 1000g/ha)，於水面下進行滴入處理。其次，於溫室內培育，於處理 21 日後調查其除草效果，和無處理者進行比較，依據下述基準來評估除草效果。結果如第 8 表所示。又，表中「—」係表示為未進行試驗。

除草效果 (生育抑制程度) 及藥害之判定基準

- 5 . . . 100% 的除草效果、藥害。
- 4 . . . 90% ~99% 的除草效果、藥害。
- 3 . . . 70% ~89% 的除草效果、藥害。
- 2 . . . 40% ~69% 的除草效果、藥害。
- 1 . . . 1% ~39% 的除草效果、藥害。

0 . . . 0% 的除草效果、藥害。

試驗例 2 對發芽後 (post) 的水田雜草之除草效果試驗

將土壤 (培養土) 填充於 75cm^2 的塑膠盆，將水田雜草稗子、螢蘭的種子播於其中，以 75cm^3 的已混合陌上菜的種子之土壤覆土後，浸水成水深 5cm 之狀態，培育於溫室內。於試驗植物為一葉期之時期，使以本發明化合物為有效成份的藥劑作為規定有效藥量 (有效成分為 1000g/ha) 之藥液進行處理。其次，於溫室內培育，於處理 21 日後調查其除草效果，和無處理者進行比較，依據試驗例 1 的基準來評估除草效果。結果如第 8 表所示。又，表中「—」係表示為未進行試驗。

試驗例 3 對移植水稻之藥害試驗

將土壤 (培養土) 填充於 75cm^2 的塑膠盆，浸水成水深 5cm 之狀態，以移植深度 1cm 移植 2 株 2 葉期的稻子 (品種：日本晴)。培育於溫室內，於移植 5 日後，使以本發明化合物為有效成份的藥劑作為規定有效藥量 (有效成分為 1000g/ha) 之藥液進行處理。其次，於溫室內培育，於處理 21 日後調查藥害，和無處理者進行比較，依據試驗例 1 的基準來評估藥害。結果如第 8 表所示。又，表中「—」係表示為未進行試驗。

【表 8 - 1】
第 8 表

化合物編號.	稻子	稗子 post	螢蘭 pre	螢蘭 post	陌上菜 pre	陌上菜 post
1-1	3	4	4	4	4	4
1-4	3	4	4	4	4	4
1-5	3	4	4	4	4	4
1-6	3	4	4	4	4	4
1-16	3	4	4	4	4	4
1-17	3	4	4	4	4	4
1-23	2	4	4	4	4	4
1-25	3	4	4	4	4	4
1-26	2	4	4	4	4	4
1-27	2	4	4	4	4	4
1-28	2	4	4	4	4	4
1-34	2	4	4	4	4	4
1-35	2	4	4	4	4	4
1-36	2	4	4	4	4	4
1-39	2	4	4	4	4	4
1-45	2	4	4	4	4	4
1-47	3	4	4	4	4	4
1-50	3	4	4	4	4	4
1-51	3	4	4	4	4	4
1-52	3	4	4	4	4	4
1-53	2	4	4	4	4	4
1-54	1	-	4	4	-	-
1-55	2	4	4	4	4	4
1-58	2	4	4	4	4	4
1-63	2	4	4	4	4	4
1-64	2	4	4	4	4	4
1-69	3	4	4	4	4	4
1-71	3	4	4	4	4	4
1-74	3	4	4	4	4	4
1-75	3	4	4	4	4	4
1-80	1	4	4	4	4	-
1-81	1	4	4	4	5	5
1-82	0	4	5	4	5	5
1-85	1	4	4	4	4	-
1-86	0	4	4	4	4	4
1-91	1	4	4	4	5	5
1-92	1	4	4	4	5	5

【表8-2】
第8表(續)

化合物編號	稻子	稗子 post	螢蘭 pre	螢蘭 post	陌上菜 pre	陌上菜 post
1-93	1	4	5	4	5	5
1-94	1	-	5	4	5	5
1-95	1	-	5	4	5	5
1-96	0	4	4	4	5	5
1-100	0	4	4	-	5	4
1-102	4	4	4	4	4	4
1-104	2	4	4	4	4	4
1-107	2	4	4	4	4	4
1-108	1	-	4	4	4	4
1-109	1	4	4	4	4	4
1-114	2	4	4	4	4	4
1-119	1	-	4	4	4	4
1-120	1	4	4	4	4	4
1-125	2	4	4	4	4	4
1-130	2	4	4	4	4	4
1-131	2	4	4	4	4	4
1-136	2	4	4	4	4	4
1-137	2	4	4	4	4	4
1-142	2	4	4	4	4	4
1-143	2	4	4	4	4	4
1-144	1	-	4	4	4	4
1-145	0	-	4	4	-	-
1-149	0	-	-	-	-	-
1-154	0	-	-	-	4	-
1-155	0	-	4	4	4	4
1-160	2	-	4	4	4	4
1-162	2	-	4	4	4	4
1-165	2	-	4	4	4	-
1-167	0	-	4	-	-	-
1-171	0	-	-	-	-	-
1-172	1	-	4	4	4	4
1-174	1	-	4	4	4	4
1-177	1	-	4	4	4	4
1-183	1	-	4	4	4	4
1-185	1	4	4	4	4	4
1-188	1	4	4	4	4	-
1-191	0	4	-	-	4	-
1-194	0	-	-	-	-	-
1-195	0	-	4	4	4	4

【表 8 - 3】

第 8 表 (續)

化合物編號	稻子	稗子 post	螢蘭 pre	螢蘭 post	陌上菜 pre	陌上菜 post
1-197	0	-	4	4	4	4
1-206	2	-	4	4	4	4
1-208	1	4	4	4	4	4
1-211	0	4	4	4	4	4
1-217	0	-	4	4	4	4
1-219	0	-	4	4	4	4
1-224	0	-	-	-	4	-
1-228	1	-	5	4	5	5
1-230	1	4	5	4	5	5
1-239	1	4	-	4	5	5
1-241	1	4	-	4	5	5
1-244	0	-	-	-	5	5
1-246	0	-	-	-	5	-
1-248	0	4	-	-	-	5
1-250	1	-	5	5	5	5
1-252	1	-	4	4	5	5
1-255	0	-	-	-	5	5
1-257	0	-	4	-	5	5
1-261	1	4	5	4	5	5
1-263	1	4	4	4	5	5
1-268	0	-	4	4	5	5
1-270	1	-	-	4	5	5
1-272	1	4	4	4	5	5
1-274	1	4	4	4	5	5
1-279	1	-	-	4	5	5
1-281	0	-	-	4	5	5
1-283	1	4	5	4	5	5
1-285	1	4	4	4	5	5
1-290	0	-	-	4	5	5
1-292	1	4	-	4	5	5
1-294	1	-	4	4	5	5
1-296	2	4	4	4	5	5
1-301	0	-	-	-	5	5
1-303	1	4	-	4	5	5
1-305	1	-	4	4	5	5
1-307	0	-	4	4	5	5
1-312	0	-	-	-	5	5
1-314	1	-	4	-	5	5

【表 8 - 4】

第 8 表 (續)

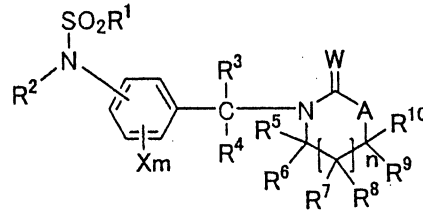
化合物編號	稻子	稗子 post	螢蘭 pre	螢蘭 post	陌上菜 pre	陌上菜 post
1-316	1	4	4	4	5	5
1-317	1	4	4	4	5	5
1-318	1	4	4	4	5	5
1-321	1	4	4	4	5	5
1-323	0	-	-	-	5	5
1-327	4	4	5	4	5	5
1-329	2	4	5	4	5	5
1-332	3	4	5	4	5	5
1-338	0	-	4	4	4	5
1-339	0	4	4	4	5	5
1-340	0	4	4	4	5	-
1-343	0	4	5	4	5	5
1-349	3	-	5	-	5	5
1-350	2	-	5	4	5	5
1-351	1	-	4	4	5	5
1-360	1	-	5	4	5	5
1-361	1	4	5	4	5	5
1-362	1	4	4	4	5	5
1-369	0	-	-	4	5	5
1-371	4	4	5	4	5	5
1-373	3	4	5	4	5	5
1-376	4	4	5	4	5	5
1-377	3	-	4	4	5	5
1-382	4	4	5	4	5	5
1-384	4	4	5	4	5	5
1-387	4	5	5	5	5	5
1-388	2	5	5	4	5	5
1-393	1	-	5	4	5	5
1-394	1	4	5	4	5	5
1-395	1	4	5	4	5	5
1-404	1	-	4	4	5	5
1-406	1	5	5	4	5	5
1-415	1	5	5	4	5	5
1-416	1	5	5	4	5	-
1-417	4	4	5	4	5	5
1-419	4	-	5	4	5	5
1-422	4	-	5	4	5	5
1-423	4	-	4	4	5	5

【表 8 - 5】
第 8 表 (續)

化合物編號	稻子	稗子 post	螢藺 pre	螢藺 post	陌上菜 pre	陌上菜 post
1-428	1	-	5	4	5	5
1-429	1	-	4	4	5	5
1-430	1	4	5	4	5	5
1-439	2	-	5	4	5	5
1-440	2	4	4	4	5	5
1-441	1	5	5	4	5	5
1-450	4	4	5	4	5	5
1-452	4	4	5	4	5	5
1-455	3	5	5	4	5	5
1-456	3	-	5	4	5	5
1-461	1	-	5	4	5	5
1-463	1	4	5	4	5	5
1-494	4	4	5	4	5	5
1-496	3	4	5	4	5	5
1-499	3	4	5	4	5	5
1-501	3	5	5	4	5	5
1-506	4	4	5	4	5	5
2-1	3	4	4	4	4	4
2-3	2	4	4	4	4	4
2-4	2	4	4	4	4	4
2-5	2	4	4	4	4	4
2-6	2	4	4	4	4	4
2-12	1	4	4	4	4	-
2-14	1	4	4	4	4	4
2-17	0	4	4	4	-	-
2-23	3	4	4	4	4	4
2-24	3	4	4	4	4	4
2-25	3	4	4	4	4	4
2-27	2	4	4	4	4	4
2-28	3	4	4	4	4	4
2-34	2	4	4	4	4	4

五、中文發明摘要：

本發明係相關於通式 (I)：



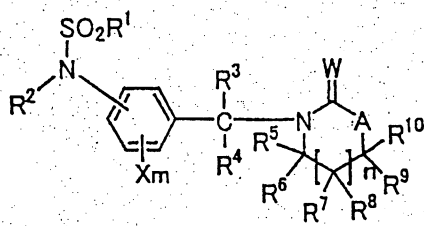
{式中，R¹係鹵(C₁-C₈)烷基。R²係H；烷氧基羰基烷基；烷羰基；取代苯氧基羰基；取代雜環烷基等。R³、R⁴、R⁵、R⁶係H；烷基；環烷基；烷氧基；鹵素基；CN等。R⁷、R⁸、R⁹及R¹⁰係H；鹵素；烷基；環烷基；取代苯烷基；OH；CN等。n係1或2。A和W係O、S。X係鹵素；烷基；烯基；環烷基；取代苯基；取代苯氧基；取代苯硫基；取代苯烷基胺羰基；OH；CN等。m係0~4。}表示的鹵烷基磺苯胺衍生物或其鹽類，與以該化合物為有效成分之除草劑及其使用方法。

本發明的化合物係一種兼具顯著的除草效果和優異的作物-雜草間的選擇性等特性之除草劑，特別有益於使用為水田用除草劑。

六、英文發明摘要：

The present invention relates to haloalkyl sulfonanilide derivatives represented by formula (I) or salts thereof, as well as relates to a herbicide using it as effective constituent and a use-method of the said herbicide.

formula (I)



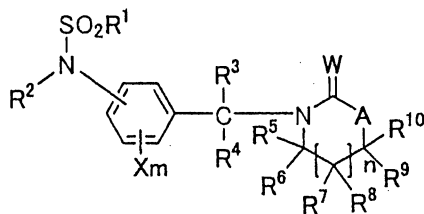
{In which, R¹ is halo(C₁-C₈)alkyl; R² is H, alkoxycarbonyl alkyl, alkylcarbonyl, substituted phenoxy carbonyl or substituted heteroalkyl etc.; R³, R⁴, R⁵ and R⁶ is H, alkyl, cycloalkyl, alkoxy, halogen or CN etc.; R⁷, R⁸, R⁹ and R¹⁰ is H, halogen, alkyl, cycloalkyl, substituted phenyl alkyl, OH or CN etc.; n is 1 or 2; A and W are O or S; X is halogen, alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, substituted phenyl, substituted phenoxy, substituted phenyl thio, substituted phenyl alkyl amino carbonyl, OH or CN etc.; m is 0~4.}

The compound of the present invention is herbicide having both significant herbicide action and excellent selectivity between crops and weeds, especially useful to be paddy-field-using herbicide.

十、申請專利範圍：

1. 一種鹵烷基磺苯胺衍生物或其鹽類，其係如通式 (I) 所示，

通式 (I)



{式中， R^1 係表示為鹵(C_1-C_8)烷基， R^2 係氫原子；(C_1-C_6)烷氧基羰基(C_1-C_6)烷基；(C_1-C_{18})烷羰基；鹵(C_1-C_6)烷羰基；苯羰基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代苯羰基；(C_1-C_{18})烷氧基羰基；(C_2-C_{18})烯氧基羰基；(C_2-C_{18})炔氧基羰基；鹵(C_1-C_6)烷氧基羰基；(C_1-C_6)烷氧基(C_1-C_6)烷氧基羰基；(C_1-C_6)烷基硫(C_1-C_6)烷氧基羰基；(C_1-C_6)烷基亞磺醯(C_1-C_6)烷氧基羰基；(C_1-C_6)烷基磺醯(C_1-C_6)烷氧基羰基；苯氧基羰基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代苯氧基羰基；苯氧基(C_1-C_6)烷基羰基；含 1~5 個選自 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代苯氧基(C_1-C_6)烷基羰基；苄氧基羰基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代苄氧基羰基；(C_1-C_6)烷基硫羰基；(C_1-C_6)烷基磺醯基；鹵(C_1-C_6)烷基磺醯基；苯基磺醯基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代苯基磺醯基；(C_1-C_6)烷基；(C_2-C_6)烯基；(C_2-C_6)炔基；苯基(C_1-C_6)烷基；

於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯基 (C₁-C₆) 烷基 ; 苯基羰基 (C₁-C₆) 烷基 ; 於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯基羰基 (C₁-C₆) 烷基 ; (C₁-C₈) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基 ; (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基 ; 可相同或相異的三 (C₁-C₆) 烷基矽烷基 (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基 ; 苯基 (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基 ; 於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯基 (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基 ; (C₁-C₆) 烷基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基 ; 苯基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基 ; 於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基 ; 苯基羰基氧 (C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基 ; 於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基 ; 單 (C₁-C₆) 烷胺基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基 ; 可相同或相異的可以相互鍵結而形成 5~8 員環之二 (C₁-C₆) 烷胺基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基 ; 苯胺基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基 ; 於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 之取代基之取代苯胺基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基 ; N- (C₁-C₆) 烷基 -N- 苯胺基羰基氧 (C₁-C₆) 烷基 ; 於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代 N- (C₁-C₆) 烷基 -N- 苯胺基羰基氧 (C₁-C₆)

烷基；苯基硫（ C_1-C_6 ）烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y（Y 係如後述）之取代基之取代苯基硫（ C_1-C_6 ）烷基；苯基磺醯（ C_1-C_6 ）烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y（Y 係如後述）之取代基之取代苯基磺醯（ C_1-C_6 ）烷基；苯基（ C_1-C_6 ）烷基硫（ C_1-C_6 ）烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y（Y 係如後述）之取代基之取代苯基（ C_1-C_6 ）烷基硫（ C_1-C_6 ）烷基；苯基（ C_1-C_6 ）烷基磺醯（ C_1-C_6 ）烷基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y（Y 係如後述）之取代基之取代苯基（ C_1-C_6 ）烷基磺醯（ C_1-C_6 ）烷基；（ C_1-C_6 ）烷基硫（ C_1-C_6 ）烷基；鹵（ C_1-C_6 ）烷基硫（ C_1-C_6 ）烷基；硫氰基（ C_1-C_6 ）烷基；雜環（ C_1-C_6 ）烷基（雜環係表示為吡啶、吡啶-N-氧化物、嘧啶、吡嘞、三嘞、呋喃、四氫呋喃、噻吩、四氫噻吩、四氫吡喃、四氫噻吡喃、噁唑、異噁唑、噁二唑、噻唑、異噻唑、噻二唑、咪唑、三唑、吡唑、吡咯、吡咯烷、酞醯亞胺或 2,3-二氫-1,2-苯并噻唑-3-酮 = 1,1-二氧化物）；或於環上含 1~4 個選自可相同或相異的 Y（Y 係如後述）之取代基之取代雜環（ C_1-C_6 ）烷基（雜環係與上述相同），

R^3 及 R^4 係表示可相同或相異的氫原子；（ C_1-C_6 ）烷基；（ C_3-C_6 ）環烷基；（ C_1-C_6 ）烷氧基；鹵原子；或氰基，又 R^3 和 R^4 係可相互鍵結形成 3~7 員環，
 R^5 及 R^6 係表示可相同或相異的氫原子；（ C_1-C_6 ）烷基；

(C₃-C₆) 環烷基；(C₁-C₆) 烷氧基；鹵原子；或氰基，
 R⁷、R⁸、R⁹ 及 R¹⁰ 係可相同或相異的氫原子；鹵原子；
 (C₁-C₆) 烷基；(C₃-C₆) 環烷基；(C₁-C₆) 烷氧基；鹵(C₁-C₆)
 烷基；(C₁-C₆) 烷氧基 (C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷基羰基
 氧 (C₁-C₆) 烷基；單 (C₁-C₆) 烷基胺基 (C₁-C₆) 烷基；
 可相同或相異的二 (C₁-C₆) 烷基胺基 (C₁-C₆) 烷基；單
 (C₁-C₆) 烷基胺基羰基 (C₁-C₆) 烷基；可相同或相異的二
 (C₁-C₆) 烷基胺基羰基 (C₁-C₆) 烷基；苯基 (C₁-C₆) 烷基；
 於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的
 取代基之取代苯基 (C₁-C₆) 烷基；苯氧基 (C₁-C₆) 烷基；
 於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的
 取代基之取代苯氧基 (C₁-C₆) 烷基；苯基；含 1~5 個選
 自可相同或相異的 Y (Y 係如後述) 的取代基之取代苯
 基；(C₁-C₆) 烷氧基羰基；單 (C₁-C₆) 烷基胺基羰基；可相
 同或相異的二 (C₁-C₆) 烷基胺基羰基；羥基；或氰基，又
 R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹ 及 R¹⁰ 係可與相鄰的取代基相互鍵結，
 藉由可以由選自可相同或相異的氧原子；硫原子；或氮
 原子 (該氮原子係可被氫原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆)
 烯基、(C₂-C₆) 炔基或環 (C₃-C₆) 烷基取代) 中的 1 或 2
 個雜原子中斷之 (C₁-C₄) 伸烷基形成 3 至 7 員環，

n 係 1 或 2，

A 係氧原子或硫原子，

W 係氧原子或硫原子，

X 係表示可為相同或相異的鹵原子；(C₁-C₆) 烷基；(C₂-C₆) 烯基；(C₂-C₆) 炔基；環(C₃-C₆) 烷基；鹵(C₁-C₆) 烷基；環鹵(C₃-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷氧基；鹵(C₁-C₆) 烷氧基；(C₁-C₆) 烷氧基(C₁-C₆) 烷基；鹵(C₁-C₆) 烷氧基(C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷硫基；鹵(C₁-C₆) 烷硫基；(C₁-C₆) 烷硫基(C₁-C₆) 烷基；鹵(C₁-C₆) 烷硫基(C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基；鹵(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基；(C₁-C₆) 烷基磺醯基；鹵(C₁-C₆) 烷基磺醯基；苯基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y(Y 係如後述) 的取代基之取代苯基；苯氧基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y(Y 係如後述) 的取代基之取代苯氧基；苯硫基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y(Y 係如後述) 的取代基之取代苯硫基；苯亞磺醯基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y(Y 係如後述) 的取代基之取代苯亞磺醯基；苯磺醯基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y(Y 係如後述) 的取代基之取代苯磺醯基；(C₁-C₆) 烷基羰基；鹵(C₁-C₆) 烷基羰基；苯羰基；含 1~5 個選自可相同或相異的 Y(Y 係如後述) 的取代基之取代苯羰基；(C₁-C₆) 烷氧基羰基；羧基；單(C₁-C₆) 烷胺基羰基；可相同或相異的二(C₁-C₆) 烷胺基羰基；苯胺基羰基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y(Y 係如後述) 的取代基之取代苯胺基羰基；苯基(C₁-C₆) 烷胺基羰基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的 Y(Y 係如後述) 之取代基之取代苯基(C₁-C₆)

烷胺基羰基；羥基或氰基， m 係 0 至 4 之整數，又 X 係可與苯環上相鄰的碳原子在一起，藉由可以由選自可相同或相異的氧原子；硫原子；或氮原子（該氮原子係可被氫原子、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 炔基或環 (C_3-C_6) 烷基取代）中的 1 或 2 個雜原子中斷之 (C_1-C_4) 伸烷基形成 5 或 6 員環，

Y 係選自可相同或相異的鹵原子；硝基； (C_1-C_6) 烷基； (C_2-C_6) 烯基； (C_2-C_6) 炔基；環 (C_3-C_6) 烷基；鹵 (C_1-C_6) 烷基；環鹵 (C_3-C_6) 烷基； (C_1-C_6) 烷氧基；鹵 (C_1-C_6) 烷氧基；氰基 (C_1-C_6) 烷氧基； (C_1-C_6) 烷氧基 (C_1-C_6) 烷氧基； (C_1-C_6) 烷硫基；鹵 (C_1-C_6) 烷硫基； (C_1-C_6) 烷基亞磺醯基；鹵 (C_1-C_6) 烷基亞磺醯基； (C_1-C_6) 烷基磺醯基；鹵 (C_1-C_6) 烷基磺醯基；苯基；具有 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、 (C_1-C_6) 烷基、 (C_2-C_6) 烯基、 (C_2-C_6) 炔基、環 (C_3-C_6) 烷基、鹵 (C_1-C_6) 烷基、環鹵 (C_3-C_6) 烷基、 (C_1-C_6) 烷氧基、鹵 (C_1-C_6) 烷氧基、 (C_1-C_6) 烷硫基、鹵 (C_1-C_6) 烷硫基、 (C_1-C_6) 烷基亞磺醯基、鹵 (C_1-C_6) 烷基亞磺醯基、 (C_1-C_6) 烷基磺醯基、鹵 (C_1-C_6) 烷基磺醯基、 (C_1-C_6) 烷羰基、鹵 (C_1-C_6) 烷羰基、 (C_1-C_6) 烷氧羰基、羧基、單 (C_1-C_6) 烷胺基羰基、可相同或相異的二 (C_1-C_6) 烷胺基羰基、羥基或氰基的取代基之取代苯基；雜環基（雜環基係表示為吡啶基、吡啶-N-氧化物基、嘧啶基、吡嗪基、三吡嗪基、呋喃

基、四氫呋喃基、噻吩基、四氫噻吩基、四氫吡喃基、四氫噻吡喃基、噁唑基、異噁唑基、噁二唑基、噻唑基、異噻唑基、噻二唑基、咪唑基、三唑基、吡唑基、吡咯基、吡咯烷基)；於環上含 1 個以上選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、環(C₃-C₆) 烷基、鹵(C₁-C₆) 烷基、環鹵(C₃-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、鹵(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、鹵(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、(C₁-C₆) 烷基磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基磺醯基、(C₁-C₆) 烷羰基、鹵(C₁-C₆) 烷羰基、(C₁-C₆) 烷氧羰基、羧基、單(C₁-C₆) 烷胺基羰基、相同或相異的二(C₁-C₆) 烷胺基羰基、羥基或氰基的取代基之取代雜環基(雜環基係與上述相同)；苯氧基；含 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、環(C₃-C₆) 烷基、鹵(C₁-C₆) 烷基、環鹵(C₃-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、鹵(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、鹵(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、(C₁-C₆) 烷基磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基磺醯基、(C₁-C₆) 烷羰基、鹵(C₁-C₆) 烷羰基、(C₁-C₆) 烷氧羰基、羧基、單(C₁-C₆) 烷胺基羰基、可相同或相異的二(C₁-C₆) 烷胺基羰基、羥基或氰基的取代基之取代苯氧基；苯硫基；含 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、環(C₃-C₆)

烷基、鹵 (C₁-C₆) 烷基、環鹵 (C₃-C₆) 烷基、(C₁-C₆)
 烷氧基、鹵 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、鹵 (C₁-C₆)
 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、鹵 (C₁-C₆) 烷基亞磺醯
 基、(C₁-C₆) 烷基磺醯基、鹵 (C₁-C₆) 烷基磺醯基、(C₁-C₆)
 烷羰基、鹵 (C₁-C₆) 烷羰基、(C₁-C₆) 烷氧羰基、羧基、
 單 (C₁-C₆) 烷胺基羰基、可相同或相異的二 (C₁-C₆) 烷
 胺基羰基、羥基或氰基的取代基之取代苯硫基；苯基亞
 磺醯基；含 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆)
 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、環 (C₃-C₆) 烷基、
 鹵 (C₁-C₆) 烷基、環鹵 (C₃-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、
 鹵 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、鹵 (C₁-C₆) 烷硫
 基、(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、鹵 (C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、
 (C₁-C₆) 烷基磺醯基、鹵 (C₁-C₆) 烷基磺醯基、(C₁-C₆)
 烷羰基、鹵 (C₁-C₆) 烷羰基、(C₁-C₆) 烷氧羰基、羧基、
 單 (C₁-C₆) 烷胺基羰基、可相同或相異的二 (C₁-C₆) 烷
 胺基羰基、羥基或氰基的取代基之取代苯基亞磺醯基；
 苯基磺醯基；含 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、
 (C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、環 (C₃-C₆)
 烷基、鹵 (C₁-C₆) 烷基、環鹵 (C₃-C₆) 烷基、(C₁-C₆)
 烷氧基、鹵 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、鹵 (C₁-C₆)
 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、鹵 (C₁-C₆) 烷基亞磺醯
 基、(C₁-C₆) 烷基磺醯基、鹵 (C₁-C₆) 烷基磺醯基、(C₁-C₆)
 烷羰基、鹵 (C₁-C₆) 烷羰基、(C₁-C₆) 烷氧羰基、羧基、

單 (C₁-C₆) 烷胺基羰基、可相同或相異的二 (C₁-C₆) 烷胺基羰基、羥基或氰基的取代基之取代苯基磺醯基；
 (C₁-C₆) 烷羰基；鹵 (C₁-C₆) 烷羰基；苯基羰基；含 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、環 (C₃-C₆) 烷基、鹵 (C₁-C₆) 烷基、環鹵 (C₃-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、鹵 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、鹵 (C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、鹵 (C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、(C₁-C₆) 烷基磺醯基、鹵 (C₁-C₆) 烷基磺醯基、(C₁-C₆) 烷羰基、鹵 (C₁-C₆) 烷羰基、(C₁-C₆) 烷氧羰基、羧基、單 (C₁-C₆) 烷胺基羰基、可相同或相異的二 (C₁-C₆) 烷胺基羰基、羥基或氰基的取代基之取代苯基羰基；(C₁-C₆) 烷氧羰基；羧基；單 (C₁-C₆) 烷胺基羰基；可相同或相異的二 (C₁-C₆) 烷胺基羰基；苯胺基羰基；於環上含 1~5 個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、環 (C₃-C₆) 烷基、鹵 (C₁-C₆) 烷基、環鹵 (C₃-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、鹵 (C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、鹵 (C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、鹵 (C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、(C₁-C₆) 烷基磺醯基、鹵 (C₁-C₆) 烷基磺醯基、(C₁-C₆) 烷羰基、鹵 (C₁-C₆) 烷羰基、(C₁-C₆) 烷氧羰基、羧基、單 (C₁-C₆) 烷胺基羰基、可相同或相異的二 (C₁-C₆) 烷胺基羰基、羥基或氰基的取代基之取代苯胺基羰基；苯基 (C₁-C₆) 烷胺基羰基；於環上含 1~5

個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基、環(C₃-C₆) 烷基、鹵(C₁-C₆) 烷基、環鹵(C₃-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基、鹵(C₁-C₆) 烷氧基、(C₁-C₆) 烷硫基、鹵(C₁-C₆) 烷硫基、(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基亞磺醯基、(C₁-C₆) 烷基磺醯基、鹵(C₁-C₆) 烷基磺醯基、(C₁-C₆) 烷羰基、鹵(C₁-C₆) 烷羰基、(C₁-C₆) 烷氧羰基、羧基、單(C₁-C₆) 烷胺基羰基、可相同或相異的二(C₁-C₆) 烷胺基羰基、羥基或氰基的取代基之取代苯基(C₁-C₆) 烷胺基羰基；羥基或氰基中的 1~5 個取代基，又 Y 係可與苯環或雜環上相鄰的碳原子或氮原子在一起，藉由可以由選自可相同或相異的氧原子；硫原子；或氮原子(該氮原子係可被氫原子、(C₁-C₆) 烷基、(C₂-C₆) 烯基、(C₂-C₆) 炔基或環(C₃-C₆) 烷基取代) 中的 1 或 2 個雜原子中斷之(C₁-C₄) 伸烷基形成 5 或 6 員環}。

2. 如申請專利範圍第 1 項之鹵烷基磺苯胺衍生物或其鹽類，其中 R¹ 係表示為氟(C₁-C₆) 烷基，R² 係氫原子；(C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷氧基羰基(C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₁₈) 烷羰基；鹵(C₁-C₆) 烷羰基；(C₁-C₁₈) 烷氧基羰基；鹵(C₁-C₆) 烷氧基羰基；(C₁-C₈) 烷氧基(C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷氧基(C₁-C₆) 烷氧基(C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷羰氧基(C₁-C₆) 烷基；或(C₁-C₆) 烷氧基羰氧基(C₁-C₆) 烷基，R³、R⁴、R⁵ 及 R⁶ 係氫原子，R⁷ 及 R⁸ 係可相同或相異的氫

原子；鹵原子；(C₁-C₆) 烷基；(C₃-C₆) 環烷基；(C₁-C₆) 烷氧基；鹵(C₁-C₆) 烷基；或(C₁-C₆) 烷氧基(C₁-C₆) 烷基，R⁹及R¹⁰係可相同或相異的氫原子；鹵原子；(C₁-C₆) 烷基；(C₃-C₆) 環烷基；(C₁-C₆) 烷氧基；鹵(C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₆) 烷氧基(C₁-C₆) 烷基；苯(C₁-C₆) 烷基；於環上含1~5個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、鹵(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基或鹵(C₁-C₆) 烷氧基的取代基之取代苯基(C₁-C₆) 烷基；苯基；含1~5個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基、鹵(C₁-C₆) 烷基、(C₁-C₆) 烷氧基或鹵(C₁-C₆) 烷氧基的取代基之取代苯基，又R⁷、R⁸、R⁹及R¹⁰係可與相鄰的取代基相互鍵結，藉由(C₁-C₄) 伸烷基形成3至7員環，m表示為0，A係氧原子，W係氧原子或硫原子。

3. 如申請專利範圍第1項之鹵烷基砜苯胺衍生物或其鹽類，其中R¹係表示為三氟甲基，R²係氫原子；(C₁-C₆) 烷基；(C₁-C₁₈) 烷氧基羰基；鹵(C₁-C₆) 烷氧基羰基；(C₁-C₈) 烷氧基(C₁-C₆) 烷基；或(C₁-C₆) 烷羰氧基(C₁-C₆) 烷基，R³、R⁴、R⁵及R⁶係氫原子，R⁷及R⁸係可相同或相異的氫原子；或(C₁-C₆) 烷基，R⁹及R¹⁰係可相同或相異的氫原子；(C₁-C₆) 烷基；(C₃-C₆) 環烷基；鹵(C₁-C₆) 烷基；苯基；含1~5個選自可相同或相異的鹵原子、(C₁-C₆) 烷基或(C₁-C₆) 烷氧基的取代基之取代苯基，又R⁷、R⁸、R⁹及R¹⁰係可與相鄰的取代基相互鍵結，藉由可以由選自

可相同或相異的氧原子；硫原子；或氮原子（該氮原子係可被氫原子或（C₁-C₆）烷基取代）中的 1 或 2 個雜原子中斷之（C₁-C₄）伸烷基形成 3 至 7 員環，m 表示為 0，A 係氧原子，W 係氧原子或硫原子。

4. 一種除草劑，其特徵係含有如申請專利範圍第 1 至 3 項中任一項之鹵烷基砒苯胺衍生物或其鹽類為有效成分。

5. 一種除草劑之使用方法，其特徵係將申請專利範圍第 4 項之除草劑的有效量處理於土壤、水田或植物。

七、指定代表圖：

- (一)本案指定代表圖為：無。
- (二)本代表圖之元件符號簡單說明：
無。

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

無。

三、發明人：(共 4 人)

姓 名：(中文/英文) ID：

1. 日野智和/HINO, TOMOKAZU
2. 山田康子/YAMADA, YASUKO
3. 重成俊彥(重成俊彥)/SHIGENARI, TOSHIHIKO
4. 豆塚弘毅(豆塚弘毅)/MAMETSUKA, KOKI

國 籍：(中文/英文)

- 1.~4. 日本
Japan

四、聲明事項：

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

申請前已向下列國家(地區)申請專利：

【格式請依：受理國家(地區)、申請日、申請案號 順序註記】

有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

日本 2006/11/17 特願 2006-312140

無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

主張專利法第三十條生物材料：

須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。