



(21) 申請案號：106129353

(22) 申請日：中華民國 106 (2017) 年 08 月 29 日

(51) Int. Cl. : A01N43/40 (2006.01) A01P3/00 (2006.01)

(30) 優先權：	2016/08/30	美國	62/381,259
	2016/08/30	美國	62/381,268
	2016/08/30	美國	62/381,273
	2016/08/30	美國	62/381,279
	2016/08/30	美國	62/381,280
	2016/08/30	美國	62/381,282
	2016/08/30	美國	62/381,285
	2016/08/30	美國	62/381,287

(71) 申請人：美商陶氏農業科學公司 (美國) DOW AGROSCIENCES LLC (US)
美國

(72) 發明人：里哥利 賈里德 W. RIGOLI, JARED W. (US)；美亞 凱文 G. MEYER, KEVIN G. (US)；姚 成林 YAO, CHENGLIN (US)；洛伊 布萊恩 A. LOY, BRIAN A. (US)；薩姆 布蘭諾 SAM, BRANNON (US)

(74) 代理人：劉法正；尹重君

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：9 項 圖式數：0 共 61 頁

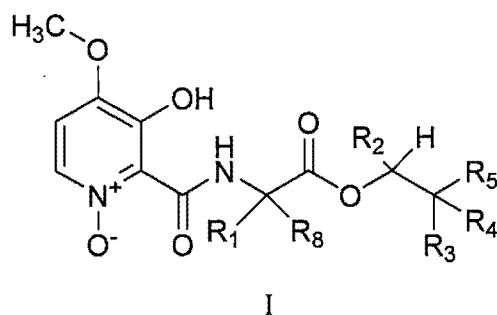
(54) 名稱

具有殺真菌活性之吡啶醯胺 N-氧化物化合物

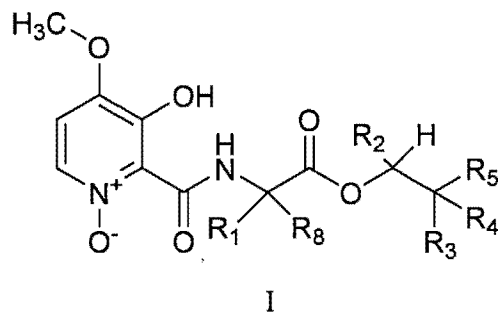
PICOLINAMIDE N-OXIDE COMPOUNDS WITH FUNGICIDAL ACTIVITY

(57) 摘要

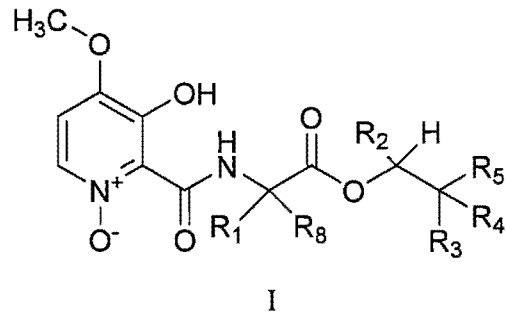
本發明係有關於式 I 之吡啶醯胺 N-氧化物及其做為殺真菌劑的用途。

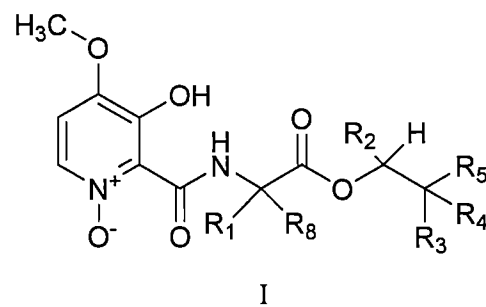


This disclosure relates to picolinamide N-oxides of Formula I and their use as fungicides.



特徵化學式：



【代表圖】**【本案指定代表圖】**：(無)**【本代表圖之符號簡單說明】**：(無)**【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】**：

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

【發明名稱】 (中文/英文)

具有殺真菌活性之吡啶醯胺 N-氧化物化合物

PICOLINAMIDE N-OXIDE COMPOUNDS WITH FUNGICIDAL ACTIVITY

【技術領域】

【0001】 本發明係有關於具有殺真菌活性之吡啶醯胺 N-氧化物化合物。

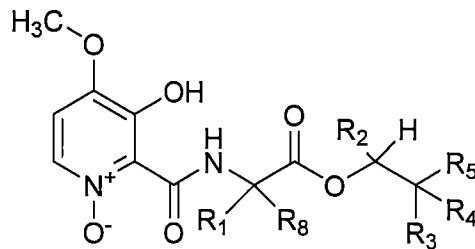
【先前技術】

【0002】 殺真菌劑是天然或合成來源之化合物，其作用係保護及/或治療植物，對抗農業相關真菌引起之傷害。一般而言，沒有單一的殺真菌劑可用於所有的情況。因此，一直持續進行研究以生產具有更好效能、較易使用且成本較低之殺真菌劑。

【發明內容】

【0003】 本發明係有關吡啶醯胺 N-氧化物及其做為殺真菌劑的用途。本發明之化合物可提供保護，對抗子囊菌類、擔子菌類、不完全菌類以及卵菌類。

【0004】 本發明的一實施例可包含式 I 化合物：



I

其中：

R₁ 為氫或 C₁-C₅ 烷基，其各自可選地被 0 個、1 個或多個 R₆ 取代；

R₂ 為氫或 C₁-C₅ 環烷基，其各自可選地被 0 個、1 個或多個 R₆ 取代；

R_3 為烷基、環烷基、芳基或雜芳基，其各自可選地被 0 個、1 個或多個 R_6 取代；

R_4 為氫、鹵基、羥基、烷基或烷氧基；

R_5 為烷基、環烷基、芳基、雜芳基、烷氧基、芳氧基或雜芳氧基，其各自可選地被 0 個、1 個或多個 R_6 取代；

R_6 為氫、烷基、芳基、醯基、鹵基、烷氧基或雜環基，其各自可選地被 0 個、1 個或多個 R_7 取代；

R_7 為氫、烷基、芳基、醯基、鹵基、烷氧基或雜環基；且

R_8 為氫或 C_1-C_5 烷基，其各自可選地被 0 個、1 個或多個 R_6 取代。

【0005】 本發明的另一實施例係包含一用於控制或預防真菌侵害之殺真菌組成物，其包括上述該等化合物及一植物學上可接受的載體材料。

【0006】 本發明的又一實施例係包含一種用於控制及預防真菌侵害植物之方法，該方法包含下列步驟：將一殺真菌有效量之一或多種上述化合物施用至真菌、植物以及鄰近植物的區域中之至少一者。

【0007】 熟習此項技術者應理解，以下術語可包含通用「R」基團在其定義內，例如「烷氧基」一詞係指-OR 取代基」。亦應理解，在以下術語之定義內，此等「R」基團出於說明之目的而被包含在內且不應被解釋為限制性的或受到關於式 I 之取代基的限制。

【0008】 術語「烷基」係指分支鏈、未分枝或飽和環狀碳鏈，包含(但不限於)甲基、乙基、丙基、丁基、異丙基、異丁基、第三丁基、戊基、己基、環丙基、環丁基、環戊基、環己基等。

【0009】 術語「烯基」係指含有一或多個雙鍵的分支鏈、未分支或環狀碳鏈，包含(但不限於)乙烯基、丙烯基、丁烯基、異丙烯基、異丁烯基、環丁烯基、環戊烯基、環己烯基等。

【0010】 術語「炔基」係指含有一或多個三鍵的分支鏈或未分支碳鏈，包含(但不限於)丙炔基、丁炔基等。

【0011】 術語「芳基」及「Ar」係指含有 0 個雜原子之任何芳香族單環或雙環。

【0012】 術語「雜環基」係指含有一或多個雜原子之任何單環或雙環之芳香族或非芳香族環。

【0013】 術語「烷氧基」係指-OR 取代基。

【0014】 術語「醯氧基」係指-OC(O)R 取代基。

【0015】 術語「氰基」係指-C≡N 取代基。

【0016】 術語「羥基」係指-OH 取代基。

【0017】 術語「胺基」係指-N(R)₂ 取代基。

【0018】 術語「芳烷氧基」係指-O(CH₂)_nAr，其中 *n* 為選自於 1、2、3、4、5 或 6 之整數。

【0019】 術語「鹵烷氧基」係指-OR-X 取代基，其中 X 為 Cl、F、Br 或 I 或其任何組合。

【0020】 術語「鹵烷基」係指烷基，其經 Cl、F、I 或 Br 或其任何組合取代。

【0021】 術語「鹵素」或「鹵基」一詞係指一或多個鹵素原子，其定義為 F、Cl、Br 及 I。

【0022】 術語「硝基」係指-NO₂ 取代基。

【0023】 術語「硫烷基」係指-SR 取代基。

【0024】 在本發明全文中，提及式 I 化合物時係亦解讀為包含全部的立體異構物，例如非對映異構體、對映異構體及其混合物。於另一實施例中，式 I 係亦解讀為包含其鹽或水合物。例示性的鹽包含(但不限於)：鹽酸鹽、氫溴酸鹽及氫碘酸鹽。

【0025】 熟習此項技術者亦應理解，除非另外指出，否則額外的取代是可允許的，只要滿足化學鍵結及應變能的原則且產物仍展現殺真菌活性即可。

【0026】 本發明之另一實施例係為式 I 化合物用於保護植物免於植物病原生物體侵害、或治療受到植物病原生物體感染的植物之用途，其包括將式 I 化合物或一包括有該化合物之組成物施用於土壤、植物、植物的一部分、葉子及/或根部。

【0027】 此外，本發明之另一實施例為一種適用於保護植物免於植物病原生物體侵害及/或治療受到植物病原生物體感染的植物之組成物，其包括式 I 化合物及一植物學上可接受之載體材料。

【圖式簡單說明】

(無)

【實施方式】

【0028】 本發明之化合物可藉由任何各種已知技術、以化合物形式或以包括有該化合物的製劑形式來施用。舉例而言，可將化合物施用於植物的根部或葉子以控制各種真菌，而不傷害該植物的商業價值。該材料可用任何一般所使用之製劑類型施用，例如，以溶液、粉劑、可濕性粉末、水懸劑或乳劑形式施用。

【0029】 較佳地，本發明之化合物係以一種包括一或多種式 I 化合物及植物學上可接受的載體之製劑形式施用。濃縮製劑可分散於水中或其他施用液體中，或者製劑可為粉劑狀或顆粒，其可在不進一步處理之情況下施用。該製劑可根據農業化學領域中的習用程序製備。

【0030】 本發明預期使用全部的載體，可通過該載體配製一或多種所述化合物以用於遞送並用作殺真菌劑。一般而言，製劑係以水性懸浮液或乳劑形式施用。這類懸浮液或乳劑可由水溶性、水可懸浮性或可乳化性之製劑產生，

所述製劑為固體時通常稱為可濕性粉末；或所述製劑為液體時通常稱為乳劑、水性懸浮液或懸浮劑。應容易瞭解到，可使用能將這些化合物添加於其中之任何材料，條件為其產生所期望之效用而不顯著干擾這些化合物做為抗真菌劑的活性。

【0031】 可壓製形成水分散性顆粒之可濕性粉末係包括一或多種式 I 化合物、惰性載劑與界面活性劑的緻密混合物。該可濕性粉末中之化合物濃度以該可濕性粉末之總重量計係可自約 10 重量%至約 90 重量%，更佳為約 25 重量%至 75 重量%。在可濕性粉末製劑的製備中，可將該化合物與任何微細粉碎固體混配，所述固體諸如為葉蠟石、滑石、白堊、石膏、漂白土、膨潤土、鎂質膨土、澱粉、酪蛋白、麩質、蒙脫石黏土、矽藻土、純矽酸鹽等等。在此操作中，通常將所述微細粉碎載體與界面活性劑與該化合物摻合並研磨。

【0032】 式 I 化合物的乳劑可在一合適的液體中包括慣用濃度的化合物，諸如該化合物的約 1 重量百分比至約 50 重量百分比（以該濃縮物之總重量計）。該化合物可溶於惰性載體中，所述惰性載體為水混溶性溶劑或為水不混溶性有機溶劑與乳化劑的混合物。該濃縮物可稀釋於水中以及油中，以形成水包油乳液形式之噴霧混合物。適用的有機溶劑包含芳香族，尤其是石油的高沸點萘與烯烴部分，諸如重芳族石腦油。亦可使用其他有機溶劑，例如包含松香衍生物之萜烯溶劑、脂族酮類（諸如環己酮）及複合醇類諸如（2-乙氧基乙醇）。

【0033】 有利於在本文中採用之乳化劑可容易由熟習此項技術者所判定，包含各種非離子、陰離子、陽離子及兩性乳化劑，或二或多種乳化劑之摻合物。有用於製備乳劑之非離子乳化劑實例包含聚伸烷二醇醚以及烷基和芳基酚、脂族醇、脂族胺或脂肪酸與乙烯氧化物、丙烯氧化物的縮合產物，諸如乙氧基化烷基酚以及用多元醇或聚氧伸烷溶解之羧酸酯。陽離子乳化劑包含

四級銨化合物及脂肪胺鹽。陰離子乳化劑包含烷芳基磺酸之油溶性鹽類（例如鈣）、硫酸化聚二醇醚之油溶性鹽類及磷酸化聚二醇醚之適當鹽類。

【0034】 可用於製備本發明之化合物之乳劑的代表性有機液體為芳香族液體，諸如二甲苯、丙基苯銜份；或混合萘銜份、礦物油、經取代之芳香族有機液體（諸如鄰苯二甲酸二辛酯）；煤油；各種脂肪酸之二烷基醯胺，特別是脂肪二醇之二甲基醯胺及二醇衍生物（諸如二乙二醇之正丁基醚、乙基醚或甲基醚、三乙二醇之甲基醚），石油銜份或烴（諸如礦物油、芳香族溶劑、石蠟油及其類似物）；植物油，諸如大豆油、菜籽油、橄欖油、蓖麻油、葵花籽油、椰子油、玉米油、棉籽油、亞麻籽油、棕櫚油、花生油、紅花油、芝麻油、桐油及其類似物；以上植物油的酯；及其類似物。兩種或兩種以上有機液體之混合物亦可用於製備乳劑。有機液體包含二甲苯及丙基苯銜份，在一些情況下，二甲苯為最佳的。界面活性分散劑通常用於液體製劑中且其量為自 0.1 至 20 重量%（以分散劑與所述一或多種化合物之總重量計）。所述製劑亦可含有其他可相容的添加劑，例如植物生長調節劑及其他用於農業的生物活性化合物。

【0035】 水性懸浮液係包括一或多種不溶於水的式 I 化合物的懸浮液，其係以自約 1 至約 50 重量百分比之濃度範圍（以該水性懸浮液之總重量計）分散於水性載體中。藉由磨細一或多種化合物，並劇烈地將磨碎之材料混合於由水和選自上述相同類型之界面活性劑組成之載體中以製備懸浮液。亦可添加諸如無機鹽類與合成或天然膠類之其它成分，以增加該水性載體的密度與黏度。

【0036】 式 I 化合物亦可以顆粒狀製劑形式施用，所述顆粒狀製劑係特別適用於施用至土壤。顆粒狀製劑通常含有自約 0.5 至約 10 重量%之化合物（以顆粒狀製劑之總重量計）分散於惰性載體中，該惰性載劑全部或大部分係由粗糙粉碎之惰性材料組成，諸如鎂質膨土、膨潤土、矽藻土、黏土或相

似的廉價物質。這類製劑通常如下製備：將所述化合物溶解於一適宜溶劑中且將其施用至已預先製成合適粒度（約 0.5 至約 3 mm 範圍內）的顆粒狀載體。適宜溶劑為所述化合物可基本上或完全溶於其中之溶劑。這類調配物亦可如下製備：將所述載體及化合物及溶劑製成糊狀或膏狀，且壓碎並乾燥以獲得所需顆粒狀粒子。

【0037】 含有式 I 化合物之粉劑可以如下製備：將呈粉末形式的一或多種化合物與一適宜粉劑狀農用載體（諸如(例如)高嶺土、研磨火山岩等）均勻混合。粉劑可合適地含有自約 1 至約 10 重量%的化合物（以粉劑之總重量計）。

【0038】 所述製劑可額外含有輔助界面活性劑以增強化合物於目標作物及生物體上之沈積、濕潤及滲透。此等輔助界面活性劑係可選地做為製劑成份或做為罐混合物使用。輔助界面活性劑的數量通常在自 0.01 至 1.0 體積%、較佳為 0.05 至 0.5 體積%之範圍內變化（以水之噴霧體積計）。適宜的輔助界面活性劑包含(但不限於)乙氧基化壬基酚、乙氧基化合成醇或乙氧基化天然醇、酯類或磺基琥珀酸之鹽類、乙氧基化有機聚矽氧、乙氧基化脂肪胺、界面活性劑與礦物油或植物油之摻合物、作物油濃縮物（(礦物油(85%) + 乳化劑(15%))）；壬基酚乙氧基化物；苧基椰脂烷基二甲基四級銨鹽；石油烴、烷基酯、有機酸及陰離子界面活性劑之摻合物；C₉ - C₁₁ 烷基聚糖苷；磷酸化醇乙氧基化物；天然一級醇(C₁₂ - C₁₆)乙氧基化物；二第 2 丁基苯酚 EO-PO 嵌段共聚物；聚矽氧烷-甲基端封物；壬基酚乙氧基化物+尿素硝酸銨；乳化甲基化種子油；十三烷醇(合成)乙氧基化物(8EO)；牛脂胺乙氧基化物(15 EO)；PEG(400)二油酸酯-99。所述製劑亦可包含水包油乳液，諸如美國專利申請案第 11/495,228 號中所揭示者，該申請案之揭示內容係以引用方式明文併入本文中。

【0039】 所述製劑可選擇地包含含有其他殺蟲化合物之組合。此類額外殺蟲化合物可為殺真菌劑、殺昆蟲劑、除草劑、殺線蟲劑、殺蟎劑、殺節肢動

物劑、殺細菌劑或其組合，其在所選擇施用之介質中係與本發明之化合物相容，且對本發明化合物之活性無拮抗性。因此，在這類實施例中，所述其他殺蟲化合物係做為增補毒劑使用，以用於相同或不同的殺蟲用途。所述式 I 化合物及殺蟲化合物之組合通常可以 1：100 至 100：1 之重量比存在。

【0040】 本發明之化合物亦可與其他殺真菌劑組合以形成殺真菌混合物及其協同混合物。本發明之殺真菌化合物常常與一或多種其他殺真菌劑結合施用以防治廣泛多種不合需要之疾病。當與其他殺真菌劑結合使用時，本發明所主張之化合物可與其他殺真菌劑一起調配、與其他殺真菌劑槽式混合或與其他殺真菌劑依次施用。此類其他殺真菌劑可包含 2-(硫氰基甲硫基)-苯并噁唑、2-苯基苯酚、8-羥基喹啉硫酸鹽、辛唑啉菌胺(ametoctradin)、呋唑磺菌胺(amisulbrom)、抗微素(antimycin)、白粉寄生孢(*Ampelomyces quisqualis*)、阿紮康唑(azaconazole)、亞托敏(azoxystrobin)、枯草芽孢桿菌(*Bacillus subtilis*)、枯草芽孢桿菌菌株 QST713、本達樂(benalaxyl)、免賴得(benomyl)、苯噁菌胺(benthiavalicarb-isopropyl)、苯甲胺基苯-磺酸鹽(benzylaminobenzene-sulfonate；BABS)、碳酸氫鹽、聯苯、噻枯唑(bismerthiazol)、比多農(bitertanol)、必殺吩(bixafen)、殺稻瘟菌素-S (blasticidin-S)、硼砂、波爾多液(Bordeaux mixture)、白可列(boscalid)、糠菌唑(bromuconazole)、布瑞莫(bupirimate)、多硫化鈣、四氯丹(captafol)、蓋普丹(captan)、貝芬替(carbendazim)、萎鏽靈(carboxin)、加普胺(carpropamid)、香芹酮(carvone)、氯芬酮(chlazafenone)、地茂散(chloroneb)、四氯異苯腈(chlorothalonil)、克氯得(chlozolate)、盾殼黴(*Coniothyrium minitans*)、氫氧化銅、辛酸銅、鹼性氯氧化銅、硫酸銅、硫酸銅(三元)、丁香菌酯(coumoxystrobin)、氧化亞銅、賽座滅(cyazofamid)、環氟菌胺(cyflufenamid)、克絕(cymoxanil)、環克座(cyproconazole)、噁菌環胺(cyprodinil)、邁隆(dazomet)、咪菌威(debacarb)、乙烯雙-(二硫胺基甲酸)二銨、益發靈(dichlofluanid)、二氯酚(dichlorophen)、二氯西莫(diclocymet)、達滅淨

(diclomezine)、氯硝胺(dichloran)、乙徽威(diethofencarb)、待克利(difenoconazole)、野燕枯(difenzoquat ion)、二氟林(diflumetorim)、達滅芬(dimethomorph)、地莫菌胺(dimoxystrobin)、達克利(diniconazole)、達克利-M、大脫蟪(dinobuton)、白粉克(dinocap)、二苯胺、大芬滅替松(dipymetitrone)、腓硫醯(dithianon)、嗎菌靈(dodemorph)、嗎菌靈乙酸酯、多寧(dodine)、多寧游離鹼、護粒松(edifenphos)、因司唑賓(enestrobin)、因司唑布林(enestroburin)、因諾司唑賓(enoxastrobin)、依普座(epoxiconazole)、噻唑菌胺(ethaboxam)、乙氧喹(ethoxyquin)、依得利(etridiazole)、凡殺同(famoxadone)、咪唑菌酮(fenamidone)、芬胺史楚賓(Fenaminstrobin)、芬瑞莫(fenarimol)、芬克座(fenbuconazole)、甲呋醯胺(fenfuram)、環醯菌胺(fenhexamid)、氟菌胺(fenoxanil)、拌種咯(fenpiclonil)、苯鏽啖(fenpropidin)、芬普福(fenpropimorph)、胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、三苯錫(fentin)、三苯醋錫(fentin acetate)、三苯羥錫(fentin hydroxide)、福美鐵(ferbam)、富米綜(ferimzone)、扶吉胺(fluzinam)、護汰寧(fludioxonil)、氟菌蟪酯(flufenoxystrobin)、氟嗎啉(flumorph)、氟吡菌胺(fluopicolide)、氟吡菌醯胺(fluopyram)、唑呋草(fluoroimide)、氟嘧菌酯(fluxastrobin)、氟喹唑(fluminconazole)、護矽得(flusilazole)、氟硫滅(flusulfamide)、氟替尼(flutianil)、福多寧(flutolanil)、護汰芬(flutriafol)、氟唑菌醯胺(fluxapyroxad)、福爾培(folpet)、甲醛、乙膦酸(fosetyl)、乙膦鋁(fosetyl-aluminium)、麥穗靈(fuberidazole)、呋霜靈(furalaxyl)、福拉比(furametpyr)、雙胍鹽(guazatine)、雙胍乙酸鹽、GY-81、六氯苯、菲克利(hexaconazole)、惡徽靈(hymexazol)、依滅列(imazalil)、硫酸依滅列、易胺座(imibenconazole)、克熱淨(iminoctadine)、克熱淨三乙酸鹽、克熱淨參(烷苯磺酸鹽)、碘徽威(iodocarb)、種菌唑(ipconazole)、艾芬哌隆(ipfenpyrazolone)、丙基喜樂松(iprobenfos)、依普同(iprodione)、顯徽威(iprovalicarb)、艾索非他米(isofetamid)、稻瘟靈(isoprothiolane)、吡唑萘菌胺(isopyrazam)、異噻菌胺(isotianil)、春日徽素

(kasugamycin)、春日黴素鹽酸鹽水合物、克收欣(kresoxim-methyl)、昆布糖(laminarin)、錳銅乃浦(mancopper)、鋅錳乃浦(mancozeb)、曼戴克敏(mandestrobin)、雙炔醯菌胺(mandipropamid)、錳乃浦(maneb)、右滅達樂(mefenoxam)、噁菌胺(mepanipyrim)、滅普寧(mepronil)、消蟎多(meptyldinocap)、氯化汞、氧化汞、氯化亞汞、滅達樂(metalaxyl)、滅達樂-M、威百畝(metam)、威百畝-鉍、威百畝-鉀、威百畝-鈉、滅特座(metconazole)、滅速克(methasulfocarb)、碘代甲烷、異硫氰酸甲酯、免得爛(metiram)、苯氧菌胺(metominostrobin)、滅芬農(metrafenone)、米多黴素(mildiomycin)、邁克尼(myclobutanil)、鈉乃浦(nabam)、異丙消(nitrothal-isopropyl)、厄瑞莫(nuarimol)、辛噻酮(octhilinone)、呋醯胺(ofurace)、油酸(脂肪酸)、肱醯菌胺(orysastrobin)、歐殺斯(oxadixyl)、奧賽普林(oxathiapiprolin)、快得寧(oxine-copper)、噁咪唑反丁烯二酸鹽(oxpoconazole fumarate)、嘉保信(oxycarboxin)、披扶座(pefurazoate)、平克座(penconazole)、賓克隆(pencycuron)、噴福芬(penflufen)、五氯苯酚、月桂酸五氯苯基酯、吡噻菌胺(penthiopyrad)、乙酸苯基汞、膦酸、苯酞(phthalide)、皮卡布西(picarbutrazox)、啞氧菌酯(picoxystrobin)、保粒黴素B(polyoxin B)、保粒黴素、多氧黴素(polyoxorim)、碳酸氫鉀、羥基喹啉硫酸鉀、撲殺熱(probenazole)、撲克拉(prochloraz)、撲滅寧(procymidone)、霜黴威(propamocarb)、霜黴威鹽酸鹽、普克利(propiconazole)、甲基鋅乃浦(propineb)、丙氧喹啉(proquinazid)、丙硫菌唑(prothioconazole)、百克敏(pyraclostrobin)、啞胺菌酯(pyrametostrobin)、啞菌酯(pyraoxystrobin)、必記福敏(pyraziflumid)、白粉松(pyrazophos)、吡菌苯威(pyribencarb)、稗草丹(pyributicarb)、比芬諾(pyrifenoxy)、派美尼(pyrimethanil)、派瑞非尼(pyriofenone)、啞菌噁唑(pyrisoxazole)、百快隆(pyroquilon)、莫克草(quinoclamine)、快諾芬(quinoxifen)、五氯硝基苯(quintozene)、大虎杖(*Reynoutria sachalinensis*)提取物、氟唑環菌胺(sedaxane)、矽硫芬(silthiofam)、矽氟唑(simeconazole)、2-苯基苯酚鈉、碳酸氫

鈉、五氯苯酚鈉、螺環菌胺(spiroxamine)、硫、SYP-Z048、焦油、得克利(tebuconazole)、tebufloquin、四氯硝基苯(tecnazene)、四克利(tetraconazole)、腐絕(thiabendazole)、賽氟滅(thifluzamide)、甲基多保淨(thiophanate-methyl)、得恩地(thiram)、汰敵寧(tiadinil)、脫克松(tolclofos-methyl)、托普洛卡(tolprocarb)、甲基益發靈(tolylfluanid)、三泰芬(triadimefon)、三泰隆(triadimenol)、咪唑嗪(triazoxide)、三環吡菌威(triclopyricarb)、三賽唑(tricyclazole)、三得芬(tridemorph)、三氟敏(trifloxystrobin)、賽福座(triflumizole)、賽福寧(triforine)、滅菌唑(triticonazole)、維利黴素(validamycin)、霜黴威(valifenalate)、霜黴滅(valiphenal)、免克寧(vinclozolin)、鋅乃浦(zineb)、益穗(ziram)、座賽胺(zoxamide)、橄欖假絲酵母(*Candida oleophila*)、尖鏟孢菌(*Fusarium oxysporum*)、黏帚黴屬(*Gliocladium* spp.)、大伏革菌(*Phlebiopsis gigantea*)、灰綠鏈黴菌(*Streptomyces griseoviridis*)、木黴菌屬(*Trichoderma* spp.)、(RS)-N-(3,5-二氯苯基)-2-(甲氧基甲基)-丁二醯亞胺、1,2-二氯丙烷、1,3-二氯-1,1,3,3-四氟丙酮水合物、1-氯-2,4-二硝基萘、1-氯-2-硝基丙烷、2-(2-十七基-2-咪唑啉-1-基)乙醇、2,3-二氫-5-苯基-1,4-二噻嗪 1,1,4,4-四氧化物、2-甲氧基乙基乙酸汞、2-甲氧基乙基氯化汞、2-甲氧基乙基矽酸汞、3-(4-氯苯基)-5-甲基羅丹寧、4-(2-硝基丙-1-烯基)苯基硫氰酸甲酯、胺丙膦酸(ampropylfos)、敵菌靈(anilazine)、氧化福美雙(azithiram)、多硫化鋇、Bayer 32394、麥鏽靈(benodanil)、敵菌脞(benquinox)、丙唑草隆(bentaluron)、千烯酸(benzamacril)；異丁基本紮瑞爾(benzamacril-isobutyl)、抑菌啉(benzamorf)、百蟻克(binapacryl)、雙(甲基汞)硫酸鹽、雙(三丁基錫)氧化物、丁硫啞(buthiobate)、枯萎鹽(cadmium calcium copper zinc chromate sulfate)、嗎菌威(carbamorph)、CECA、克氯綜(chlobenthiazole)、雙胺靈(chloraniformethan)、苯咪唑菌(chlorfenazole)、四氯喹噁啉(chlorquinox)、甘寶素(climbazole)、雙(3-苯基水楊酸)銅、鉻酸鋅銅、硫雜靈(cufraneb)、硫酸胛銅、福美銅氟(cuprobam)、環菌胺(cyclafuramid)、氰菌

靈(cypendazole)、酯菌胺(cyprofuram)、癸磷錫(decapentin)、大克隆(dichlone)、菌核利(dichlozoline)、苄氯三唑醇(diclobutrazol)、二甲嘧啶(dimethirimol)、鄰敵蟎消(dinocton)、硝辛酯(dinosulfon)、硝丁酯(dinoterbon)、雙硫氧吡啶(dipyriithione)、滅菌磷(ditalimfos)、多地辛(dodicin)、敵菌酮(drazoxolon)、EBP、ESBP、乙環唑(etaconazole)、益地安(etem)、乙嘧醇(ethirim)、敵克松(fenamino-sulf)、咪菌脞(fenapanil)、種衣酯(fenitropan)、三氟苯唑(fluotrimazole)、二甲呋醯胺(furcarbanil)、呋菌唑(furconazole)、順式呋菌唑、拌種胺(furmecyclox)、呋菌隆(furophanate)、果綠定(glyodine)、灰黃黴素(griseofulvin)、丙烯酸喹啉酯(halacrinat)、Hercules 3944、環己硫磷(hexylthiofos)、ICIA0858、壬氧磷胺(isopamphos)、氯苯咪菌酮(isovaledione)、滅鏽胺(mebenil)、咪卡病西(mecarbinzid)、間氯敵菌酮(metazoxolon)、呋菌胺(methfuroxam)、氰胍甲汞(methylmercury dicyandiamide)、噻菌胺(metsulfovax)、代森環(milneb)、糠氯酸酐(mucochloric anhydride)、米克啉(myclozolin)、*N*-3,5-二氯苯基-丁二醯亞胺、*N*-3-硝基苯基衣康醯亞胺、遊黴素(natamycin)、*N*-乙基汞-4-甲苯磺醯苯胺、雙(二甲基二硫胺基甲酸)鎳、OCH、二甲基二硫胺基甲酸苯基汞、硝酸苯基汞、氯瘟磷(phosdiphen)、硫菌威(prothiocarb)；硫菌威鹽酸鹽、比鏽靈(pyracarbolid)、啖菌脞(pyridinitril)、吡氯靈(pyroxychlor)、吡氧呋(pyroxyfur)、喹烯酮(quinacetol)；喹烯酮硫酸鹽、醯菌脞(quinazamid)、喹唑(quinconazole)、吡咪唑(rabenzazole)、水楊醯苯胺(salicylanilide)、SSF-109、戊苯砜(sultropen)、福美雙聯(tecoram)、噻二氟(thiadifluor)、噻菌脞(thicyofen)、硫氯苯亞胺(thiochlorfenphim)、多保淨(thiophanate)、克殺蟎(thioquinox)、替氧咪(tioxymid)、威菌磷(triamiphos)、嘧菌醇(triarimol)、丁三唑(triazbutil)、水楊菌胺(trichlamide)、福美甲肫(urbacid)、氰菌胺(zarilamid)及其任何組合。

【0041】 此外，本文中所述之化合物可與在所選用於施用之介質中與本發明之化合物相容、且對本發明化合物之活性無拮抗性的其他農藥結合，所述

農藥包含殺昆蟲劑、殺線蟲劑、殺蟎劑、殺節肢動物劑、殺細菌劑或其組合，以形成其農藥混合物及協同混合物。本發明之殺真菌化合物可與一或多種其他農藥結合施用，以防治更廣泛多種之不被期望的害蟲。當與其他農藥結合使用時，當前所主張的化合物可與其他農藥一起調配、與其他農藥槽混或與其他農藥依序施用。典型的殺昆蟲劑包含(但不限於)：1,2-二氯丙烷、阿巴汀(abamectin)、歐殺松(acephate)、啖蟲脒(acetamiprid)、家蠅磷(acethion)、乙醯蟲腈(acetoprole)、阿納寧(acrinathrin)、丙烯腈(acrylonitrile)、阿斐多匹朋(afidopyropen)、棉靈威(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、涕滅虱威(aldoxycarb)、艾氏劑(aldrin)、丙烯除蟲菊酯(allethrin)、阿洛胺菌素(allosamidin)、除害威(allyxycarb)、 α -賽滅寧(alpha-cypermethrin)、 α -蛻皮激素(alpha-ecdysone)、 α -安殺番(alpha-endosulfan)、賽果(amidithion)、滅害威(aminocarb)、胺吸磷(amiton)、草酸胺吸磷(amiton oxalate)、三亞蟎(amitraz)、毒藜鹼(anabasine)、乙基殺撲磷(athidathion)、印楝素(azadirachtin)、亞滅松(azamethiphos)、穀速松-乙酯(azinphos-ethyl)、穀速松-甲酯(azinphos-methyl)、偶氮磷(azothoate)、六氟矽酸鋇、熏菊酯(barthrin)、惡蟲威(bendiocarb)、免扶克(benfuracarb)、殺蟲磺(bensultap)、 β -賽扶寧(beta-cyfluthrin)、 β -賽滅寧(beta-cypermethrin)、畢芬寧(bifenthrin)、生物丙烯菊酯(bioallethrin)、生物苜呋菊酯(bioethanomethrin)、生物氯菊酯(biopermethrin)、雙三氟蟲脒(bistrifluron)、硼砂、硼酸、溴氟苯胺(broflanilide)、溴苯烯磷(bromfenvinfos)、溴烯殺(bromocyclen)、溴-DDT、溴硫磷(bromophos)、乙基溴硫磷(bromophos-ethyl)、合殺威(bufencarb)、布芬淨(buprofezin)、畜蟲威(butacarb)、特嘸硫磷(butathiofos)、丁酮威(butocarboxim)、丁酯磷(butonate)、丁酮虱威(butoxycarboxim)、硫線磷(cadusafos)、砷酸鈣、多硫化鈣、毒殺芬(camphechlor)、氯滅殺威(carbanolate)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、二硫化碳、四氯化碳、三硫磷(carbophenothion)、丁基加保扶(carbosulfan)、培丹(cartap)、培丹鹽酸鹽、剋安勃(chlorantraniliprole)、冰片丹

(chlorbicyclen)、氯丹(chlordane)、十氯酮(chlordecone)、殺蟲脒(chlordimeform)、殺蟲脒鹽酸鹽、氯氧磷(chlorethoxyfos)、克凡派(chlorfenapyr)、克芬松(chlorfenvinphos)、克福隆(chlorfluazuron)、氯甲磷(chlormephos)、氯仿、氯化苦(chloropicrin)、氯膦肟磷(chlorphoxim)、氯吡啶磷(chlorprazophos)、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、蟲蟻磷(chlorthiophos)、環蟲醯肼(chromafenozide)、瓜菊酯 I(cinerin I)、瓜菊酯 II、瓜菊酯、順式苜呋菊酯(cismethrin)、氯酰草磷(clacyfos)、地蟲威(cloethocarb)、氯氰碘柳胺(closantel)、噠蟲胺(clothianidin)、乙醯亞砷酸銅、砷酸銅、環烷酸銅、油酸銅、蠅毒磷(coumaphos)、畜蟲磷(coumithoate)、克羅米通(crotamiton)、丁烯磷(crotoxyphos)、育畜磷(crufomate)、冰晶石(cryolite)、苯腈磷(cyanofenphos)、殺螟腈(cyanophos)、果蟲磷(cyanthoate)、氰蟲醯胺(cyantraniliprole)、環胺普羅(cyclaniliprole)、環蟲菊酯(cyclethrin)、乙氰菊酯(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、賽酚寧(cyphenothrin)、賽滅淨(cyromazine)、畜蟬磷(cythioate)、DDT、脫羧呋喃(decarbofuran)、第滅寧(deltamethrin)、田樂磷(demephion)、田樂磷-O、田樂磷-S、內吸磷(demeton)、甲基內吸磷(demeton-methyl)、內吸磷-O、甲基內吸磷-O (demeton-O-methyl)、內吸磷-S、甲基內吸磷-S (demeton-S-methyl)、砒吸磷(demeton-S-methylsulphon)、汰芬諾克(diafenthiuron)、氯亞胺硫磷(dialifos)、矽藻土、大利松(diazinon)、異氯硫磷(dicapthon)、除線磷(dichlofenthion)、二氯松(dichlorvos)、二氯滅座替(dicloromezotiaz)、敵來死(dicresyl)、雙特松(dicrotophos)、地昔尼爾(dicyclanil)、地特靈(diieldrin)、二福隆(diflubenzuron)、雙羥丙茶鹼(dilor)、四氟甲醚菊酯(dimefluthrin)、甲氟磷(dimefox)、地麥威(dimetan)、大滅松(dimethoate)、苜菌酯(dimethrin)、甲基毒蟲畏(dimethylvinphos)、敵蠅威(dimetilan)、消蟻酚(dinex)、dinex-diclexine、丙硝酚(dinoprop)、戊硝酚(dinosam)、呋蟲胺(dinotefuran)、苯蟲醚(diofenolan)、蔬果磷(dioxabenzofos)、

二氧威(dioxacarb)、敵殺磷(dioxathion)、二硫松(disulfoton)、噁喃磷(dithicrofos)、d-檸檬烯(d-limonene)、DNOC、DNOC-鋁、DNOC-鉀、DNOC-鈉、多拉克汀(doramectin)、蛻皮甾酮(ecdysterone)、因滅汀(emamectin)、因滅汀苯甲酸鹽、EMPC、烯炔菊酯(empenthrin)、安殺番(endosulfan)、因毒磷(endothion)、安特靈(endrin)、EPN、保幼醚(epofenonane)、依立諾克丁(eprinomectin)、生物烯丙菊酯(esdepalléthrine)、益化利(esfenvalerate)、艾他福斯(etaphos)、乙硫苯威(ethiofencarb)、愛殺松(ethion)、乙蟲清(ethiprole)、益果(ethoate-methyl)、普伏松(ethoprophos)、甲酸乙酯、乙基-DDD、二溴化乙烯、二氯化乙烯、氧化乙烯、依芬寧(etofenprox)、乙嘧硫磷(etrifos)、EXD、胺磷磷(famphur)、芬滅松(fenamiphos)、抗蟎唑(fenazaflor)、皮蠅硫磷(fenclorphos)、乙苯威(fenethacarb)、五氟苯菊酯(fenfluthrin)、撲滅松(fenitrothion)、仲丁威(fenobucarb)、非諾克林(fenoxacrim)、芬諾克(fenoxycarb)、吡氯氰菊酯(fenpirithrin)、芬普寧(fenpropathrin)、豐索磷(fensulfothion)、芬殺松(fenthion)、乙基芬殺松(fenthion-ethyl)、芬化利(fenvalerate)、費普尼(fipronil)、弗美托奎(flometoquin)、氟啶蟲醯胺(flonicamid)、氟蟲雙醯胺(flubendiamide)、氟氯雙苯隆(flucofuron)、氟環脲(flucycloxuron)、護賽寧(flucythrinate)、氟芬內林(flufenerim)、氟芬隆(flufenoxuron)、三氟醚(flufenprox)、丁烯氟蟲腈(flufiprole)、氟菲殺虱(fluhexafon)、氟吡呋喃酮(flupyradifurone)、福化利(fluvalinate)、地蟲磷(fonofos)、複滅蟎(formetanate)、複滅蟎鹽酸鹽、安果(formothion)、藻蟎威(formparanate)、藻蟎威鹽酸鹽、丁苯硫磷(fosmethilan)、福司吡酯(fospirate)、丁硫環磷(fosthietan)、呋線威(furathiocarb)、抗蟲菊(furethrin)、 γ -賽洛寧(gamma-cyhalothrin)、 γ -HCH、半蟎醚(halfenprox)、合芬隆(halofenozide)、HCH、HEOD、飛布達(heptachlor)、氯氟醚菊酯(heptafluthrin)、庚烯磷(heptenophos)、速殺硫磷(heterophos)、六伏隆(hexaflumuron)、HHDN、愛美松(hydramethylon)、氰化氫、烯蟲乙酯(hydroprene)、海昆威(hyquincarb)、益達

胺(imidacloprid)、依普寧(imiprothrin)、因得克(indoxacarb)、碘甲烷、IPSP、依殺松(isazofos)、碳氫靈(isobenzan)、水胺硫磷(isocarbophos)、異艾氏劑(isodrin)、異柳磷(isofenphos)、甲基異柳磷(isofenphos-methyl)、葉蟬散(isoprocarb)、稻瘟靈(isoprothiolane)、異拌磷(isothioate)、加福松(isoxathion)、伊維菌素(ivermectin)、茉莉菊酯 I (jasmolin I)、茉莉菊酯 II、碘硫磷(jodfenphos)、保幼激素 I、保幼激素 II、保幼激素 III、κ-聯苯菊酯(kappa-bifenthrin)、κ-七氟苯菊酯(kappa-tefluthrin)、氯戊環(kelevan)、烯蟲炔酯(kinoprene)、λ-賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、砷酸鉛、雷皮菌素(lepimectin)、溴苯磷(leptophos)、靈丹(lindane)、啞蟲磷(lirimfos)、祿芬隆(lufenuron)、噻啞磷(lythidathion)、馬拉松(malathion)、丙蟎氰(malonoben)、疊氮磷(mazidox)、滅蚜磷(mecarbam)、甲基滅蚜磷(mecarphon)、滅蚜松(menazon)、地安磷(mephosfolan)、氯化亞汞、倍硫磷亞砒(mesulfenfos)、美氟綜(metaflumizone)、蟲蟎畏(methacrifos)、達馬松(methamidophos)、滅大松(methidathion)、滅賜克(methiocarb)、殺蟲乙烯磷(methocrotophos)、納乃得(methomyl)、美賜平(methoprene)、甲氧基氯(methoxychlor)、滅芬諾(methoxyfenozide)、溴化甲烷、異硫氰酸甲酯、甲基氯仿、二氯甲烷、甲氧苄氟菊酯(metofluthrin)、速滅威(metolcarb)、惡蟲酮(metoxadiazone)、美文松(mevinphos)、茲克威(mexacarbate)、密滅汀(milbemectin)、米爾倍黴素肟(milbemycin oxime)、丙胺氟(mipafox)、滅蟻靈(mirex)、殺蟲雙(molosultap)、氧苄氟菊酯(momfluorothrin)、亞素靈(monocrotophos)、殺蟲單(monomehypo)、殺蟲單(monosultap)、茂果(morphothion)、莫昔克丁(moxidectin)、萘肱磷(naftalofos)、二溴磷(naled)、萘、菸鹼、氟蟻靈(nifluridide)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、硝乙脲噻啞(nithiazine)、戊氰威(nitrilacarb)、諾伐隆(novaluron)、多氟脲(noviflumuron)、氧樂果(omethoate)、歐殺滅(oxamyl)、滅多松(oxydemeton-methyl)、異亞砒磷(oxydeprofos)、砒拌磷(oxydisulfoton)、對二氯苯、巴拉松(parathion)、甲基巴

拉松(parathion-methyl)、氟幼脲(penfluron)、五氯苯酚、百滅寧(permethrin)、芬
硫磷(phenkapton)、苯醚菊酯(phenothrin)、賽達松(phenthoate)、福瑞松(phorate)、
裕必松(phosalone)、硫環磷(phosfolan)、益滅松(phosmet)、對氯硫磷
(phosnichlor)、福賜米松(phosphamidon)、磷、巴賽松(phoxim)、甲基巴賽松
(phoxim-methyl)、甲胺啼磷(pirimetaphos)、比加普(pirimicarb)、乙基亞特松
(pirimiphos-ethyl)、甲基亞特松(pirimiphos-methyl)、亞砷酸鉀、硫氰化鉀
(potassium thiocyanate)、pp'-DDT、普亞列寧(prallethrin)、早熟素 I (precocene I)、
早熟素 II、早熟素 III、乙醯嘧啶磷(primidophos)、布飛松(profenofos)、環丙氟
靈(profluralin)、蟬虱威(promacyl)、猛殺威(promecarb)、丙蟲磷(propaphos)、巴
胺磷(propetamphos)、安丹(propoxur)、乙噻唑磷(prothidathion)、普硫松
(prothiofos)、發硫磷(prothoate)、丙苯煙菊酯(protrifenbute)、派氟米德
(pyflubumide)、吡唑硫磷(pyraclufos)、氟蟲腓(pyrafluprole)、白粉松
(pyrazophos)、派瑞斯寧(pyresmethrin)、必列寧 I(pyrethrin I)、必列寧 II、除蟲
菊精(pyrethrins)、比達本(pyridaben)、啶蟲丙醚(pyridalyl)、噻嗪硫磷
(pyridaphenthion)、吡氟喹啉(pyrifluquinazon)、嘧蟻醚(pyrimidifen)、嘧蟻胺
(pyriminostrobin)、嘧硫磷(pyrimitate)、派瑞樂(pyriprole)、百利普芬
(pyriproxyfen)、苦木(quassia)、拜裕松(quinalphos)、甲基拜裕松(quinalphos-
methyl)、畜寧磷(quinothion)、碘醚柳胺(rafoxanide)、列滅寧(resmethrin)、魚藤
精(rotenone)、魚尼丁(ryania)、藜蘆鹼(sabadilla)、八甲磷(schradan)、司拉克丁
(selamectin)、矽護芬(silafluofen)、矽膠、亞砷酸鈉、氟化鈉、六氟矽酸鈉、硫
氰酸鈉、蘇硫磷(sophamide)、賜諾特(spinetoram)、賜諾殺(spinosad)、螺甲蟻
酯(spiromesifen)、螺蟲乙酯(spirotetramat)、磺苯醚隆(sulcofuron)、磺苯醚隆-鈉、
氟蟲胺(sulfluramid)、治螟磷(sulfotep)、氟啶蟲胺腈(sulfoxaflor)、硫醯氟、硫
丙磷(sulprofos)、 τ -福化利(tau-fluvalinate)、噻蟻威(tazimcarb)、TDE、得芬諾
(tebufenozide)、得芬瑞(tebufenpyrad)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、得福隆

(teflubenzuron)、七氟菊酯(tefluthrin)、亞培松(temephos)、TEPP、環戊烯丙菊酯(terallethrin)、託福松(terbufos)、四氯乙烷、樂本松(tetrachlorvinphos)、治滅寧(tetramethrin)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、氟氰蟲醯胺(tetraniliprole)、 θ -賽滅寧(theta-cypermethrin)、噻蟲啉(thiacloprid)、噻蟲嗪(thiamethoxam)、苯噻硫磷(thicrofos)、抗蟲威(thiocarboxime)、硫賜安(thiocyclam)、硫賜安草酸鹽、硫敵克(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、甲基乙拌磷(thiometon)、殺蟲雙(thiosultap)、殺蟲雙-二鈉、殺蟲雙-單鈉、蘇雲金素(thuringiensin)、替奧沙芬(tioxazafen)、脫芬瑞(tolfenpyrad)、泰滅寧(tralomethrin)、拜富寧(transfluthrin)、反式苜氯菊酯(transpermethrin)、苯蟻噻(triarathene)、啞蚜威(triazamate)、三落松(triazophos)、三氯松(trichlorfon)、異皮蠅磷(trichlormetaphos-3)、毒壤磷(trichloronat)、三氯丙氧磷(trifenofofos)、三福派瑞姆(triflumezopyrim)、三福隆(triflumuron)、混滅威(trimethacarb)、烯蟲硫酯(triprene)、蚜滅多(vamidothion)、凡尼普羅(vaniliprole)、XMC、滅殺威(xylylcarb)、 ξ -賽滅寧(zeta-cypermethrin)、丙硫噁唑磷(zolaprofos)及其任何組合。

【0042】 此外，本文中所述之化合物可與在所選用於施用之介質中與本發明之化合物相容、且對本發明化合物之活性無拮抗性的除草劑組合，以形成其農藥混合物及協同混合物。本發明之殺真菌化合物可與一或多種除草劑結合施用，以防治更廣泛多種之不被期望的植物。當與除草劑結合使用時，當前所主張的化合物可與除草劑一起調配、與除草劑槽混或與除草劑依序施用。典型的除草劑包括(但不限於)：4-CPA；4-CPB；4-CPP；2,4-D；3,4-DA；2,4-DB；3,4-DB；2,4-DEB；2,4-DEP；3,4-DP；2,3,6-TBA；2,4,5-T；2,4,5-TB；乙草胺(acetochlor)、三氟羧草醚(acifluorfen)、苯草醚(aclonifen)、丙烯醛(acrolein)、甲草胺(alachlor)、草毒死(allidochlor)、禾草滅(alloxydim)、烯丙醇、五氯戊酮酸(alorac)、安默屈迪(ametridione)、莠滅淨(ametryn)、安米布嗪(amibuzin)、胺唑草酮(amicarbazone)、醯嘧磺隆(amidosulfuron)、環丙嘧啶酸

(aminocyclopyrachlor)、氯胺吡啶酸(aminopyralid)、甲基胺草磷(amiprofos-methyl)、殺草強(amitrole)、胺基磺酸銨、莎稗磷(anilofos)、疏草隆(anisuron)、黃草靈(asulam)、莠去通(atraton)、莠去津(atrazine)、草芬定(azafenidin)、四唑嘧磺隆(azimsulfuron)、疊氮淨(aziprotryne)、燕麥靈(barban)、BCPC、氟丁醯草胺(beflubutamid)、草除靈(benazolin)、苯卡巴腓(bencarbazon)、氟草胺(benfluralin)、呋草磺(benfuresate)、苄嘧磺隆(bensulfuron)、地散磷(bensulide)、滅草松(bentazone)、胺酸殺(benzadox)、雙苯嘧草酮(benzfendizone)、苄草胺(benzipram)、苯并雙環酮(benzobicyclon)、吡草酮(benzofenap)、氟草黃(benzofluor)、新燕靈(benzoylprop)、苯噻隆(benzthiazuron)、雙環吡喃酮(bicyclopyrone)、必芬諾(bifenox)、畢拉草(bilanafos)、雙草醚(bispyribac)、硼砂、除草定(bromacil)、溴保腓(bromobonil)、溴丁醯草胺(bromobutide)、溴酚肟(bromofenoxim)、溴苯腓(bromoxynil)、溴莠敏(brompyrazon)、丁草胺(butachlor)、氟丙嘧草酯(butafenacil)、抑草磷(butamifos)、丁烯草胺(butenachlor)、丁硫咪唑酮(buthidazole)、丁噻隆(buthiuron)、地樂胺(butralin)、丁苯草酮(butroxydim)、炔草隆(buturon)、丁草敵(butylate)、二甲次膦酸(cacodylic acid)、唑草胺(cafenstrole)、氯酸鈣、氰胺化鈣、坎苯敵氯(cambendichlor)、除草隆(carbasulam)、長殺草(carbetamide)、卡波靈(carboxazole)、氯脯靈(chlorprocarb)、唑草酮(carfentrazone)、CDEA、CEPC、甲氧除草醚(chlomethoxyfen)、克爛本(chloramben)、丁醯草胺(chloranocryl)、炔禾靈(chlorazifop)、可樂津(chlorazine)、氯溴隆(chlorbromuron)、氯炔靈(chlorbufam)、赤羅隆(chloreturon)、伐草克(chlorfenac)、燕麥酯(chlorfenprop)、氟咪殺(chlorflurazole)、氯甲丹(chlorflurenol)、氯草敏(chloridazon)、氯嘧磺隆(chlorimuron)、草枯醚(chlornitrofen)、三氯丙酸(chloroPON)、綠麥隆(chlorotoluron)、枯草隆(chloroxuron)、羥敵草腓(chloroxynil)、氯苯胺靈(chlorpropham)、氯磺隆(chlorsulfuron)、敵草索(chlorthal)、草克樂

(chlorthiamid)、吲哚酮草酯(cinidon-ethyl)、環庚草醚(cinmethylin)、醚磺隆(cinosulfuron)、咯草隆(cisanilide)、克草同(clethodim)、可啞奈特(clidinate)、炔草酯(clodinafop)、氯伏草(clofop)、可滅蹤(clomazone)、稗草胺(clomeprop)、調果酸(cloprop)、克勞普草酮(cloproxydim)、畢克草(clopyralid)、氯酯磺草胺(cloransulam)、CMA、硫酸銅、CPMF、CPPC、噻草醚(credazine)、甲酚(cresol)、苄草隆(cumyluron)、氰草淨(cyanatryn)、氰草津(cyanazine)、環草敵(cycloate)、環比瑞摩(cyclopyrimorate)、環磺隆(cyclosulfamuron)、環殺草(cycloxydim)、環莠隆(cycluron)、氰氟草酯(cyhalofop)、牧草快(cyperquat)、環草津(cyprazine)、三環塞草胺(cyprazole)、環丙草胺(cypromid)、殺草隆(daimuron)、茅草枯(dalapon)、邁隆(dazomet)、敵草樂(delachlor)、甜菜安(desmedipham)、敵草淨(desmetryn)、燕麥敵(di-allate)、汰克草(dicamba)、敵草腓(dichlobenil)、氯雙脲(dichloralurea)、苄胺靈(dichlormate)、滴丙酸(dichlorprop)、滴丙酸-P、禾草靈(diclofop)、雙氯磺草胺(diclosulam)、迭森刈(diethamquat)、乙醯甲草胺(diethatyl)、戊味禾草靈(difenopenten)、枯莠隆(difenoxyuron)、苯敵快(difenzoquat)、吡氟草胺(diflufenican)、二氟吡隆(diflufenzopyr)、噁唑隆(dimefuron)、哌草丹(dimepiperate)、二甲草胺(dimethachlor)、異戊乙淨(dimethametryn)、二甲噻草胺(dimethenamid)、二甲噻草胺-P、草滅散(dimexano)、地米達脞(dimidazon)、敵樂胺(dinitramine)、地樂特(dinofenate)、丙硝酚(dinoprop)、戊硝酚(dinosam)、地樂酚(dinoseb)、特樂酚(dinoterb)、草乃敵(diphenamid)、異丙淨(dipropetryn)、敵草快(diquat)、賽松(disul)、氟硫草定(dithiopyr)、達有龍(diuron)、DMPA、DNOC、DSMA、EBEP、甘草津(eglinazine)、草多索(endothal)、三唑磺(epronaz)、EPTC、抑草蓬(erbon)、戊草丹(esprocarb)、乙丁烯氟靈(ethalfluralin)、胺苯磺隆(ethametsulfuron)、噻二唑隆(ethidimuron)、抑草威(ethiolate)、乙呋草黃(ethofumesate)、氯氟草醚(ethoxyfen)、乙氧嘧磺隆(ethoxysulfuron)、硝草酚

(etinofen)、乙胺草醚(etnipromid)、乙氧苯草胺(etobenzanid)、EXD、芬納草胺(fenasulam)、涕丙酸(fenoprop)、精噁唑禾草靈(fenoxaprop)、精噁唑禾草靈-P、非諾磺(fenoxasulfone)、芬昆諾三酮(fenquinotrione)、芬特可(fenteracol)、噁唑禾草靈(fenthiaprop)、四唑醯草胺(fentrazamide)、非草隆(fenuron)、硫酸亞鐵、麥草伏(flamprop)、麥草伏-M、嘧啶磺隆(flazasulfuron)、雙氟磺草胺(florasulam)、伏寄普(fluzifop)、伏寄普-P、異丙吡草酯(fluzolate)、氟酮磺隆(flucarbazon)、氟吡磺隆(flucetosulfuron)、氟消草(fluchloralin)、氟噁草胺(flufenacet)、三吡氟草胺(flufenican)、氟噁草酯(flufenpyr)、唑嘧磺草胺(flumetsulam)、氟奮乃靜(flumezin)、氟烯草酸(flumiclorac)、丙炔氟草胺(flumioxazin)、炔草胺(flumipropyn)、伏草隆(fluometuron)、消草醚(fluorodifen)、乙羧氟草醚(fluoroglycofen)、唑啶草(fluorimidine)、氟除草醚(fluoronitrofen)、氟硫隆(fluothiuron)、氟胺草唑(flupoxam)、丙嘧草酯(flupropacil)、四氟丙酸(flupropanate)、氟啶嘧磺隆(flupyr-sulfuron)、氟啶草酮(fluridone)、氟咯草酮(flurochloridone)、氟草定(fluroxypyr)、呋草酮(flurtamone)、氟噁草酯(fluthiacet)、氟磺胺草醚(fomesafen)、甲醯嘧磺隆(foramsulfuron)、殺木膦(fosamine)、氟呋草醚(furyloxyfen)、草銨膦(glufosinate)、草銨膦-P、草甘膦(glyphosate)、氟氯吡啶酯(haloxifen)、氟硝磺醯胺(halosafen)、氯吡嘧磺隆(halosulfuron)、氟啶草(haloxydine)、精吡氟氯禾靈(haloxypop)、精吡氟氯禾靈-P、六氯丙酮、六氟鹽(hexaflurate)、菲殺淨(hexazinone)、咪草酸(imazamethabenz)、甲氧咪草菸(imazamox)、甲咪唑菸酸(imazapic)、依滅草(imazapyr)、滅草啞(imazaquin)、咪草菸(imazethapyr)、唑吡嘧磺隆(imazosulfuron)、茚草酮(indanofan)、茚噁氟草胺(indaziflam)、碘保腓(iodobonil)、碘甲烷、碘甲磺隆(iodosulfuron)、艾芬磺隆(iofensulfuron)、碘苯腓(ioxynil)、抑草津(ipazine)、三唑醯草胺(ipfencarbazon)、伊嘧丹(iprymidam)、草特靈(isocarbamid)、異草定(isocil)、丁噁草酮(isomethiozin)、異草完隆

(isonoruron)、異普林特(isopolinate)、異丙樂靈(isopropalin)、異丙隆(isoproturon)、異噁隆(isouron)、異噁草胺(isoxaben)、異噁氯草酮(isoxachlortole)、異噁唑草酮(isoxaflutole)、異噁草醚(isoxapyrifop)、卡草靈(karbutilate)、克特殺(ketospiradox)、乳氟禾草靈(lactofen)、環草定(lenacil)、利穀隆(linuron)、MAA、MAMA、MCPA、MCPA-硫基乙酯、MCPB、甲氯丙酸(mecoprop)、甲氯丙酸-P、甲基特樂酯(medinoterb)、苯噻醯草胺(mefenacet)、氟磺醯草胺(mefluidide)、滅莠津(mesoprazine)、甲基二磺隆(mesosulfuron)、甲基磺草酮(mesotrione)、威百畝(metam)、噁唑醯草胺(metamifop)、苯嗪草酮(metamitron)、吡草胺(metazachlor)、雙醚氯吡嘧磺隆(metazosulfuron)、二甲噻草伏(metflurazon)、甲基苯噻隆(methabenzthiazuron)、甲樂靈(methalpropalin)、滅草唑(methazole)、甲硫苯威(methiobencarb)、甲惡噻草醚(methiozolin)、滅草恆(methiuron)、醚草通(methometon)、蓋草津(methoprotryne)、溴化甲烷、異硫氰酸甲酯、甲基殺草隆(methyldymron)、吡喃隆(metobenzuron)、溴穀隆(metobromuron)、異丙甲草胺(metolachlor)、磺草唑胺(metosulam)、甲氧隆(metoxuron)、賽克津(metribuzin)、甲磺隆(metsulfuron)、草達滅(molinate)、庚醯草胺(monalide)、特噁唑隆(monisouron)、單氯乙酸、綠穀隆(monolinuron)、滅草隆(monuron)、伐草快(morfamquat)、MSMA、萘丙胺(naproanilide)、敵草胺(napropamide)、萘草胺(naptalam)、萘草胺-M (naptalam-M)、草不隆(neburon)、菸嘧磺隆(nicosulfuron)、氟氯草胺(nipyraclofen)、磺樂靈(nitralin)、除草醚(nitrofen)、三氟甲草醚(nitrofluorfen)、達草滅(norflurazon)、草完隆(noruron)、OCH、坪草丹(orbencarb)、鄰-二氯苯、嘧苯胺磺隆(orthosulfamuron)、胺磺樂靈(oryzalin)、丙炔噁草酮(oxadiargyl)、噁草酮(oxadiazon)、草噻松(oxapyrazon)、環氧嘧磺隆(oxasulfuron)、噁嗪草酮(oxaziclomefone)、乙氧氟草醚(oxyfluorfen)、對氟隆(parafluron)、巴拉割(paraquat)、克草猛(pebulate)、天竺葵酸(pelargonic acid)、二甲戊樂靈(pendimethalin)、平速爛(penoxsulam)、五氯苯酚、戊醯苯草

胺(pentanochlor)、環戊噁草酮(pentoxazone)、氟草磺胺(perfluidone)、烯草胺
 (pethoxamid)、棉胺寧(phenisopham)、甜菜寧(phenmedipham)、甜菜寧-乙酯、
 稀草隆(phenobenzuron)、乙酸苯基汞、畢克爛(picloram)、氟吡草胺
 (picolinafen)、唑啞草酯(pinoxaden)、哌草磷(piperophos)、亞砷酸鉀、疊氮化鉀、
 氰酸鉀、丙草胺(pretilachlor)、氟嘧磺隆(primisulfuron)、環丙腈津(procyazine)、
 胺基丙氟靈(prodiamine)、氟唑草胺(profluazol)、環丙氟靈(profluralin)、環苯草
 酮(profoxydim)、甘撲津(proglinazine)、撲滅通(prometon)、撲草淨(prometryn)、
 撲草胺(propachlor)、敵稗(propanil)、啞草酯(propaquizafop)、撲滅津(propazine)、
 苯胺靈(propham)、異丙草胺(propisochlor)、丙苯磺隆(propoxycarbazone)、丙嘧
 磺隆(propyrisulfuron)、戊炔草胺(propyzamide)、甲硫磺樂靈(prosulfalin)、苄草
 丹(prosulfocarb)、氟磺隆(prosulfuron)、撲滅生(proxan)、廣草胺(prynachlor)、
 比達農(pydanon)、雙唑草腈(pyraclonil)、吡草醚(pyraflufen)、磺醯草吡唑
 (pyrasulfotole)、吡唑特(pyrazolynate)、吡嘧磺隆(pyrazosulfuron)、苄草唑
 (pyrazoxyfen)、嘧啶肟草醚(pyribenzoxim)、稗草丹(pyributicarb)、氯草定
 (pyriclor)、吡啶達醇(pyridafol)、噻草特(pyridate)、環酯草醚(pyriftalid)、嘧草
 醚(pyriminobac)、嘧啶硫蕃(pyrimisulfan)、嘧硫草醚(pyrithiobac)、派羅克殺草
 磺(pyroxasulfone)、甲氧磺草胺(pyroxulam)、二氯喹啉酸(quinclorac)、喹草酸
 (quinmerac)、莫克草(quinoclamine)、氯藻胺(quinonamid)、快伏草(quizalofop)、
 快伏草-P、硫氰苯乙胺(rhodethanil)、嘧嘧磺隆(rimsulfuron)、苯嘧磺草胺
 (saflufenacil)、精異丙甲草胺(S-metolachlor)、另丁津(sebuthylazine)、密草通
 (secbumeton)、西殺草(sethoxydim)、環草隆(siduron)、西瑪津(simazine)、西瑪
 通(simeton)、西草淨(simetryn)、SMA、亞砷酸鈉、疊氮化鈉、氯酸鈉、磺草
 酮(sulcotrione)、草克死(sulfallate)、甲磺草胺(sulfentrazone)、甲嘧磺隆
 (sulfometuron)、磺醯磺隆(sulfosulfuron)、硫酸、磺洋唐平(sulglycapin)、滅草
 靈(swep)、TCA、牧草胺(tebutam)、得葡隆(tebuthiuron)、特呋喃隆

(tefuryltrione)、環磺酮(tembotrione)、吡喃草酮(tepraloxydim)、特草定(terbacil)、特草靈(terbucarb)、猛殺草(terbuchlor)、甲氧去草淨(terbumeton)、特丁津(terbuthylazine)、去草淨(terbutryn)、四氟隆(tetrafluron)、甲氧噻草胺(thenylchlor)、噻氟隆(thiazafluron)、噻草定(thiazopyr)、噻二唑胺(thidiazimin)、噻苯隆(thidiazuron)、噻酮磺隆(thiencarbazone-methyl)、噻吩磺隆(thifensulfuron)、禾草丹(thiobencarb)、氟丙嘧草酯(tiafenacil)、仲草丹(tiocarbazil)、硫胺草啶鹼(tioclorim)、硝黃草酮(tolpyralate)、苯吡唑草酮(topramezone)、肱草酮(tralkoxydim)、氟酮磺草胺(triafamone)、野麥畏(triallate)、醚苯磺隆(triasulfuron)、三嗪氟草胺(triaziflam)、苯磺隆(tribenuron)、殺草畏(tricamba)、綠草定(triclopyr)、滅草環(tridiphane)、草達津(trietazine)、三氟啶磺隆(trifloxysulfuron)、三氟草嗪(trifludimoxazin)、氟樂靈(trifluralin)、氟胺磺隆(triflusulfuron)、垂伏普(trifop)、精禾草克(trifopsime)、三羥基三嗪、三甲隆(trimeturon)、三丙丹(tripropindan)、草達克(tritac)、三氟甲磺隆(tritosulfuron)、滅草猛(vernolate)及二甲苯草胺(xylachlor)。

【0043】 本發明之另一實施例為一種用於防治或預防真菌侵害之方法。此方法包括將一殺真菌有效量的一或多種式 I 化合物施用於土壤、植物、根部、葉子或真菌所在地、或欲預防感染的所在地(例如施用於穀類或葡萄植物)。所述化合物係適於以殺真菌含量處理各種植物，同時展現低植物毒性。所述化合物係有用於以保護劑及/或噴灑滅蟲劑兩種方式使用。

【0044】 已發現該等化合物具有顯著的殺真菌作用，特別是對於農業用途。多種所述化合物係特別有效用於農業作物及園藝植物。

【0045】 熟習此項技術者應理解，該等化合物針對前述真菌之功效確立了所述化合物做為殺真菌劑的一般效用。

【0046】 所述化合物具有針對真菌病原體的廣泛活性範圍。例示性病原體可包含(但不限於)以下疾病的致病原：小麥葉斑病(小麥葉枯病菌(*Zymoseptoria*

tritici)、小麥褐銹病(小麥葉鏽菌(*Puccinia triticina*))、小麥條銹病(條形柄鏽菌(*Puccinia striiformis*))、蘋果瘡痂病(蘋果黑星病菌(*Venturia inaequalis*))、葡萄藤白粉病(葡萄白粉病菌(*Uncinula necator*))、大麥日燒病(大麥雲紋病菌(*Rhynchosporium secalis*))、稻熱病(水稻稻瘟病(*Pyricularia oryzae*))、大豆銹病(大豆鏽菌(*Phakopsora pachyrhizi*))、小麥穎枯病(穎枯殼小球腔菌(*Leptosphaeria nodorum*))、小麥白粉病(小麥白粉病菌(*Blumeria graminis f. sp. tritici*))、大麥白粉病(大麥白粉病菌(*Blumeria graminis f. sp. hordei*))、葫蘆科白粉病(二孢白粉菌(*Erysiphe cichoracearum*))、葫蘆科炭疽病(葫蘆科刺盤孢(*Colletotrichum lagenarium*))、甜菜葉斑病(甜菜尾孢菌(*Cercospora beticola*))、番茄早疫病(番茄早疫病菌(*Alternaria solani*))及大麥斑點病(禾旋孢腔菌(*Cochliobolus sativus*))。所施用的活性材料確切量不僅取決於所施用之特定活性材料，而且取決於所需具體作用、欲防治之真菌物種及其生長階段，以及待與化合物接觸之植物部分或其他產物。因此，所有化合物及含有所述化合物的製劑在相似濃度時可能不是同樣有效的或不能抵抗相同物種的真菌。

【0047】 所述化合物在以疾病抑制及植物學上可接受的量用於植物時為有效的。術語「疾病抑制及植物學上可接受的鹽」係指殺死或抑制期望防治之植物疾病，但對植物無顯著毒性之化合物數量。此數量通常為約 0.1 至約 1000 ppm（百萬分之一），其中 1 至 500 ppm 為較佳的。所需化合物之確切濃度隨著欲防治之真菌疾病、所採用之製劑類型、施用方法、具體植物物種、氣候條件等而變化。適宜的施用量通常在約 0.10 至約 4 磅/英畝（約 0.01 至 0.45 公克每平方公尺， g/m^2 ）範圍內。

【0048】 如熟習此項技術者對於本文中之教示的理解而清楚，可在不喪失所尋求之作用的情況下擴展或改變本文中給定之任何範圍或所需值。

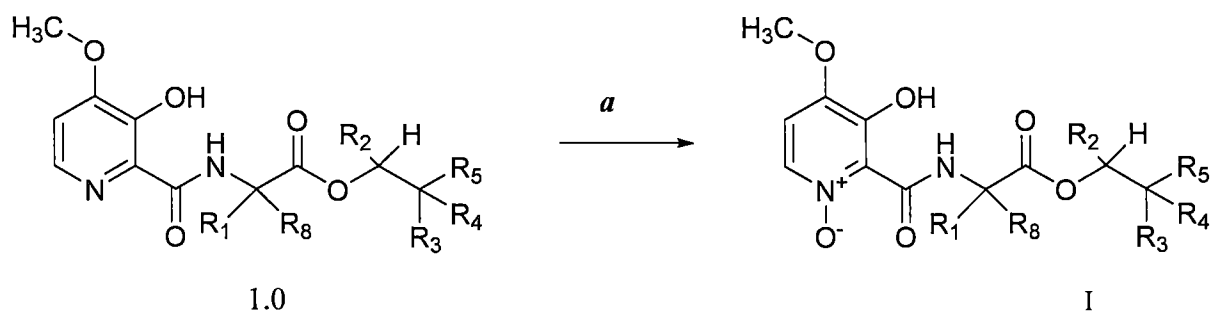
【0049】 式 I 化合物可使用熟知的化學程序製得。在本發明中未特別提及之媒介物係為可商購的、可藉由化學文獻中所揭示之途徑製得、或可易於由市售起始物質利用標準程序合成。

一般流程

【0050】 以下流程說明生成式(I)之吡啶鹽胺 N-氧化物化合物的方法。以下描述及實例係出於說明之目的而提供，不應將其理解為在取代基或取代模式方面加以限制。

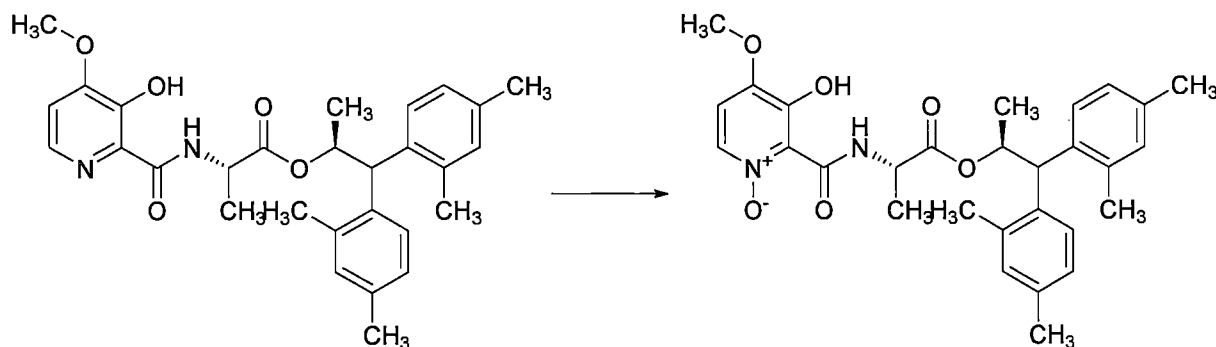
【0051】 式 I 化合物（其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 及 R_8 如最初所定義）係可根據流程 1 步驟 *a* 中概述之方法製備。式 1.0 化合物（其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 及 R_8 如最初所定義）係可通過美國專利申請案 WO 2016/109289、WO 2016/109257 及 WO 2016/109302 中概述之程序製備。式 1.0 化合物係可在約 0°C 至 50°C 的溫度下，於極性溶劑（諸如二氯甲烷(CH_2Cl_2)）中用氧化劑（諸如 *m*-氯過氧苯甲酸(*m*CPBA)）處理以得到式 I 化合物，其中 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 及 R_8 如最初所定義，如在步驟 *a* 中所示。熟習此項技術者應理解，諸如式 I 之化合物亦可使用其它氧化劑來製備，包含(但不限於)：過氧化氫、過氧化氫-尿素複合物、單過氧鄰苯二甲酸鎂六水合物(MMPP)、過氧醋酸、過一硫酸氫鉀、過氯酸鈉或二甲基二環氧乙烷。

流程 1



實例

【0052】 實例 1：製備 2-(((*S*)-1-(((*S*)-1,1-雙(2,4-二甲基苯基)丙烷-2-基)氧基)-1-氧代丙烷-2-基)胺甲醯基)-3-羥基-4-甲氧基吡啶 1-氧化物。化合物 1。



將*rac*-氯過氧苯甲酸($\leq 70\%$, 0.025 g, 0.102 mmol)添加至(*S*)-1,1-雙(2,4-二甲基苯基)丙烷-2-基(3-羥基-4-甲氧基甲基吡啶醯基)-*L*-丙胺酸(WO 2016/109257) (0.025 g, 0.051 mmol)之 CH_2Cl_2 (0.51 mL)溶液。在室溫下攪拌該混合物過夜。在減壓情況下濃縮該混合物，並經由急速層析法(4 g 矽膠管柱)，使用 0-45%丙酮/己烷混合物做為溶析液來純化粗製殘餘物，以得到呈白色泡沫之標題化合物(21 mg, 80%產率)。 ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 14.31 (s, 1H), 12.64 (d, $J = 7.0$ Hz, 1H), 7.85 (d, $J = 7.2$ Hz, 1H), 7.17 (d, $J = 7.9$ Hz, 1H), 7.11 (d, $J = 7.7$ Hz, 1H), 6.98 – 6.88 (m, 3H), 6.80 (s, 1H), 6.75 (d, $J = 7.1$ Hz, 1H), 5.67 (dq, $J = 10.2, 6.1$ Hz, 1H), 4.52 – 4.38 (m, 2H), 3.96 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.30 (d, $J = 6.2$ Hz, 3H), 1.11 (d, $J = 7.2$ Hz, 3H). IR (薄膜) 2934, 1736, 1644, 1569, 1533, 1480, 1454, 1301, 1207, 1155, 1030, 911, 808, 733 cm^{-1} . ESIMS m/z 507.2 [(M+H)⁺].

【0053】 本發明化合物之化合物結構、外觀及製備方法如下表 1 所示。表 1 所示化合物之分析數據係如下表 2 所示。

【0054】 實例 A：殺真菌活性的評估：小麥葉斑病(小麥葉枯病菌；拜耳(Bayer)編碼 SEPTTR)：

【0055】 將工業級的材料溶解於丙酮中，接著與 9 倍體積之含 110 ppm Triton X-100 的水(H₂O)混合。使用自動隔間噴霧器施用該殺真菌劑溶液至小麥幼苗上至溢流。在進一步操作之前，使全部經噴灑的植物風乾。除非另有陳述，使用前述方法評估所有殺真菌劑對於所有目標疾病的活性。亦使用軌道式噴霧施用法來評估對小麥葉斑病及褐鏽病活性，在此情況下中，殺真菌劑係配製成的 EC 製劑，其在噴霧溶液中含有 0.1%的 Trycol 5941。

【0056】 小麥植物 (Yuma 品種) 係於溫室中 在 50%礦質土/50%無土 Metro 混合物中，從種子開始生長至第一片葉子完全萌發為止，每盆 7-10 株幼苗。在殺真菌劑處理之前或之後，以小麥葉枯病菌的孢子水懸浮液接種這些植物。在接種後，將該等植物保持在 100%相對濕度中 (於 20°C 下，在避光露水室(dew chamber)中一天，然後在光照露水室中兩至三天)，以使孢子發芽並感染葉子。接著將該等植物轉移到溫度設定為 20°C 的溫室中以便疾病之發展。當疾病症狀完全表現在未經處理之植物的第一片葉子上時，按照 0 至 100%的疾病嚴重度等級來評定感染程度。使用經處理的植物上相對於未處理的植物之疾病嚴重度比率來計算疾病防治百分比。評估結果係顯示於下表 4 中。

【0057】 實例 B：殺真菌活性的評估：麥褐鏽病 (小麥葉鏽菌(*Puccinia triticina*)；同義詞：小麥葉鏽病菌(*Puccinia recondita* f. sp. tritici)；拜耳編碼 PUCCRT)：

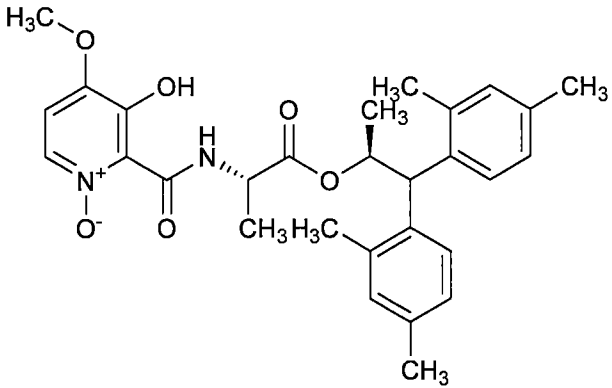
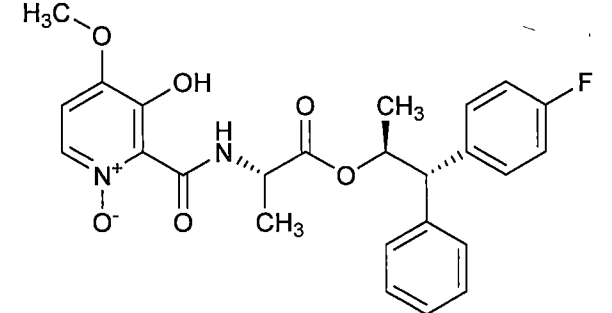
【0058】 小麥植物 (Yuma 品種) 係於溫室中 在 50%礦質土/50%無土 Metro 混合物中，從種子開始生長至第一片葉子完全萌發為止，每盆 7-10 株幼苗。在殺真菌劑處理之前或之後，以小麥葉鏽菌的孢子水懸浮液接種這些植物。在接種後，使植物保持在 22°C 下之 100%相對濕度的避光露水室中過夜，以使孢子發芽並感染葉子。接著將該等植物轉移到溫度設定為 24°C 的溫室中以便疾病之發展。殺真菌劑的配製、施用及病害評定係遵循實例 A 中所述之程序。評估結果係顯示於下表 4 中。

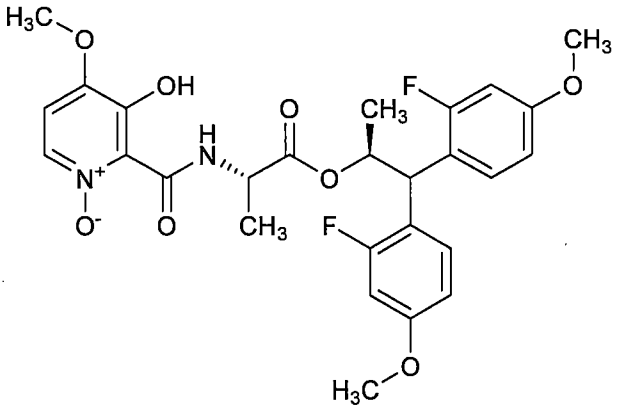
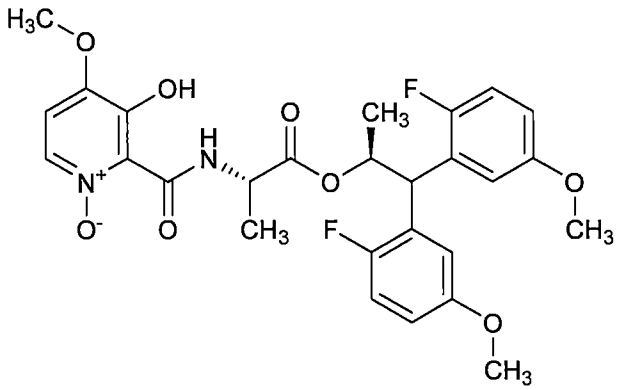
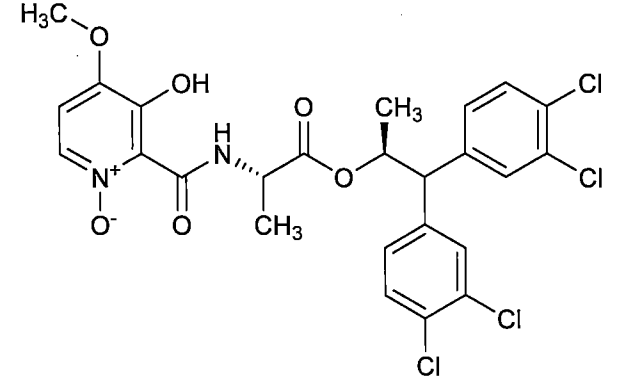
【0059】 實例 C：殺真菌活性的評估：亞洲大豆鏽病（大豆鏽菌 (*Phakopsora pachyrhizi*)；拜耳編碼 PHAKPA）：

【0060】 將工業級的材料溶解於丙酮中，接著與 9 倍體積之含 0.011% Tween 20 的 H₂O 混合。使用自動隔間噴霧器施用該殺真菌劑溶液至大豆幼苗上至溢流。在進一步操作之前，使全部經噴灑的植物風乾。

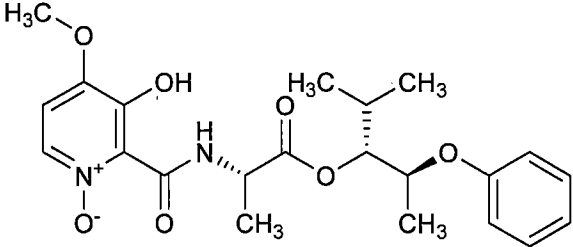
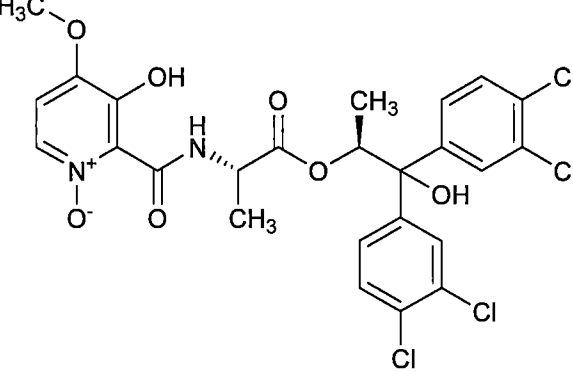
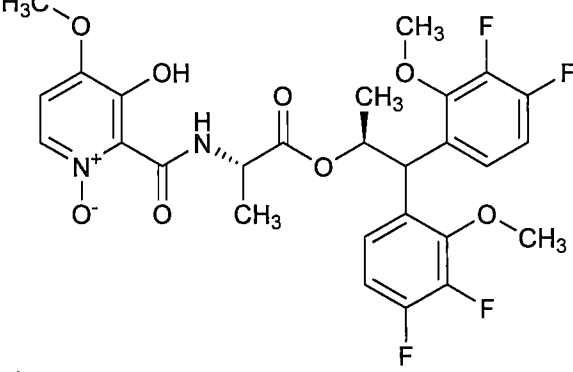
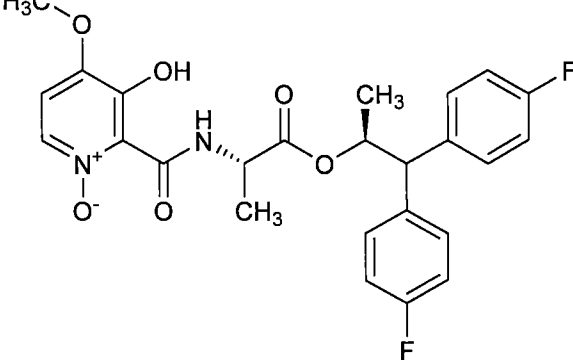
【0061】 大豆植物（品種 Williams 82）係在無土 Metro 混合物中生長，每盆一株植物。使用兩週齡幼苗進行測試。在殺真菌劑處理之前 3 天或在殺真菌劑處理之後 1 天接種植物。在 22°C 及 100%相對溼度之暗露水室中培育植物 24 小時，接著轉移至 23°C 下的生長室中以便疾病之發展。對經噴灑的葉子評定疾病嚴重度。評估結果係顯示於下表 5 中。

表 1. 化合物結構、製備方法及外觀

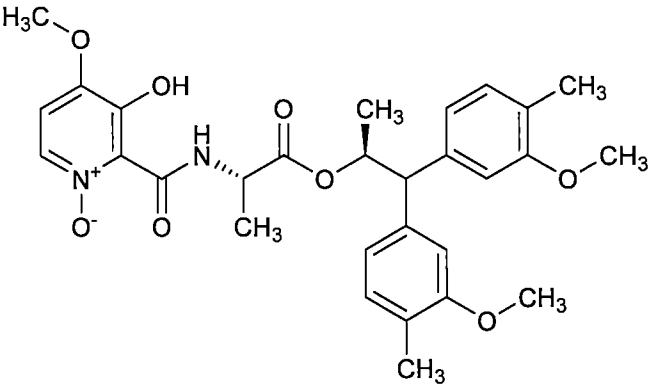
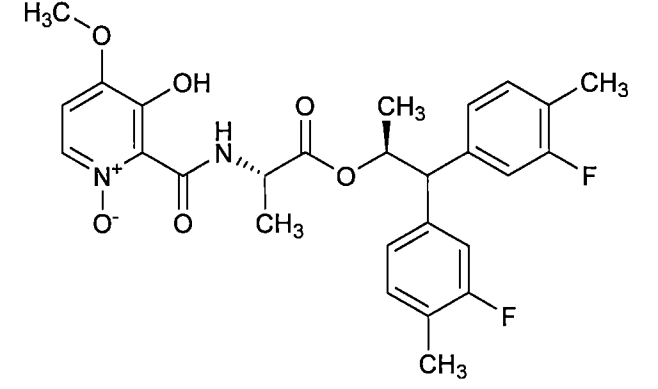
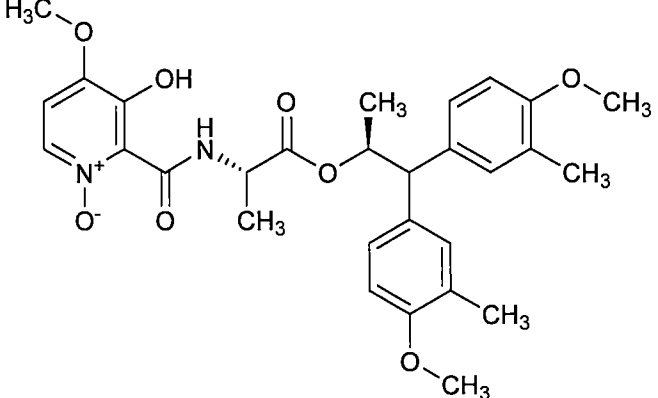
Cmpd. No.	結構	製備根據的實例	外觀
1		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫
2		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫

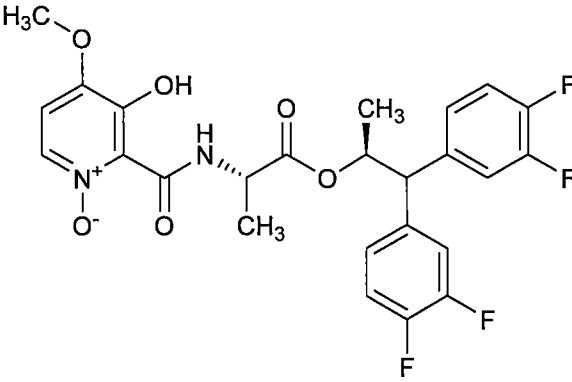
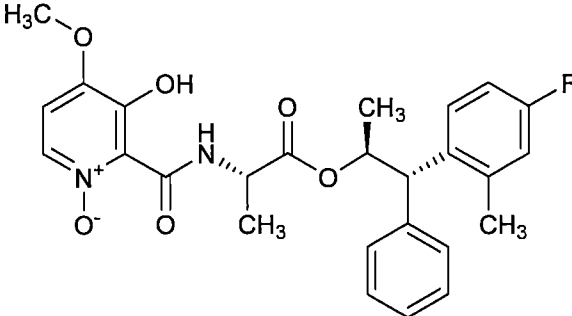
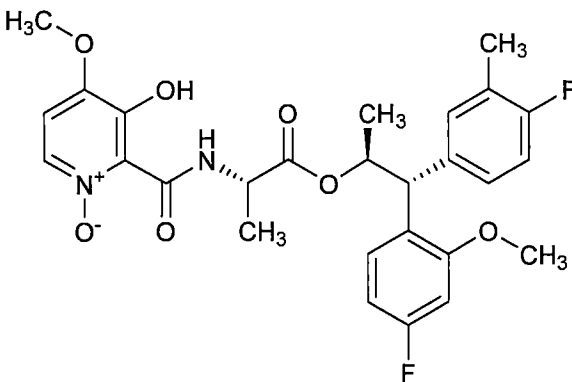
Cmpd. No.	結構	製備根據的實例	外觀
3		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫
4		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫
5		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫

Cmpd. No.	結構	製備根據的實例	外觀
6		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫
7		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫
8		WO 2016/109289 實例 1	黏稠油狀物
9		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫

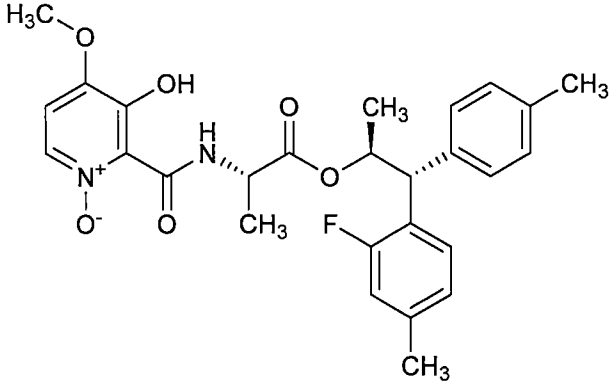
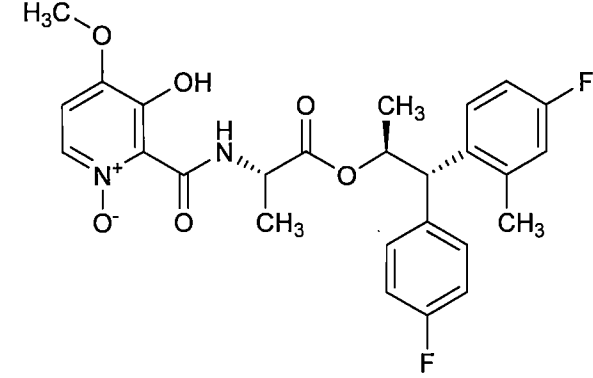
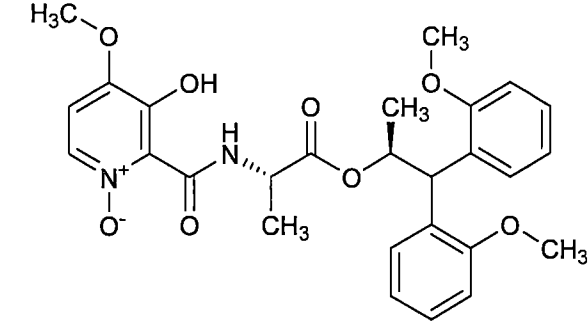
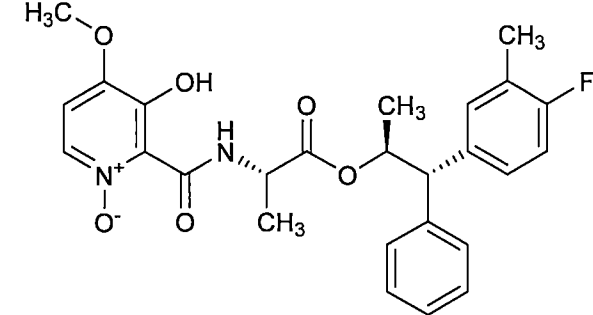
Cmpd. No.	結構	製備根據的實例	外觀
10		WO 2016/109302 實例 1	黏稠油狀物
11		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫
12		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫
13		WO 2016/109257 實例 1	玻璃狀白色固體

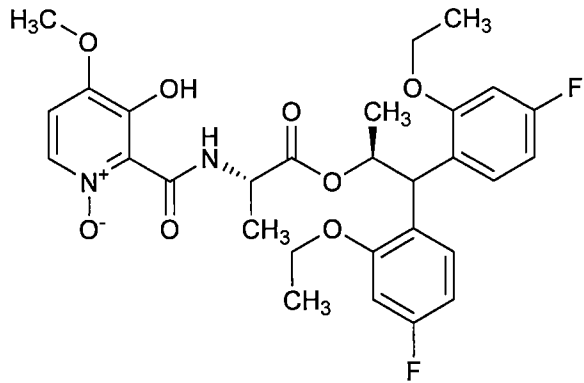
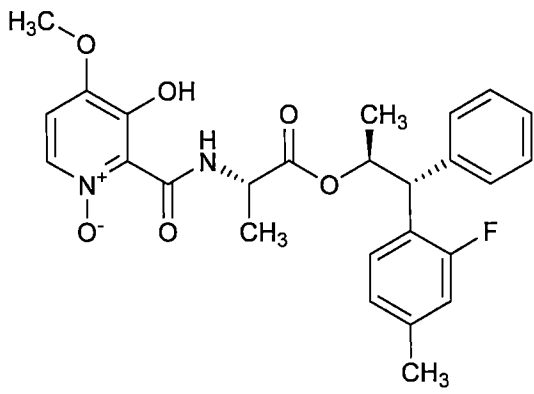
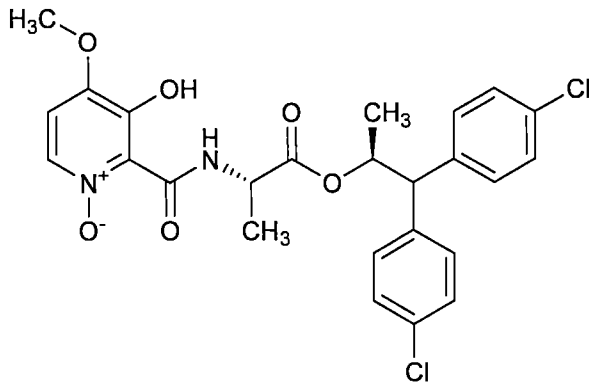
Cmpd. No.	結構	製備根據的實例	外觀
14		WO 2016/109257 實例 1	黃色半固體
15		WO 2016/109257 實例 1	白色半固體
16		WO 2016/109257 實例 1	黃色/橘色半固體
17		WO 2016/109257 實例 1	白色半固體

Cmpd. No.	結構	製備根據的實例	外觀
18		WO 2016/109257 實例 1	黃色半固體
19		WO 2016/109257 實例 1	透明無色油狀物
20		WO 2016/109257 實例 1	淡黃色半固體

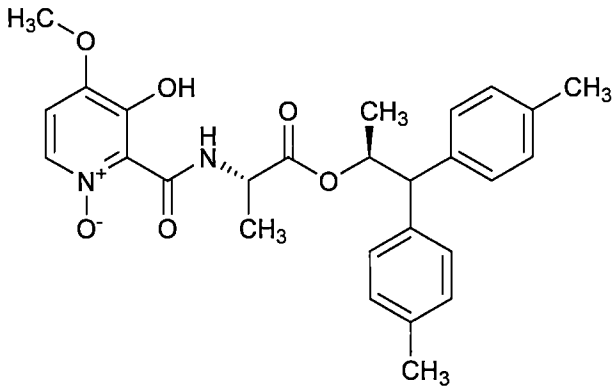
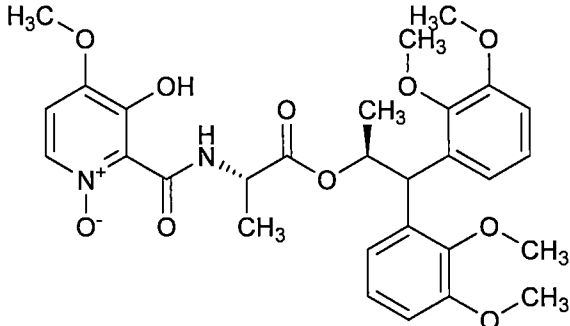
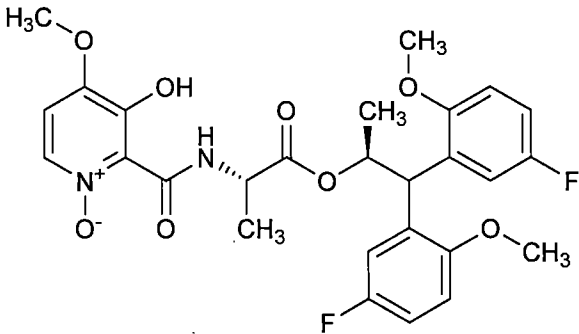
Cmpd. No.	結構	製備根據的實例	外觀
21		WO 2016/109257 實例 1	白色半固體
22		WO 2016/109257 實例 1	無色油狀物
23		WO 2016/109257 實例 1	無色油狀物

Cmpd. No.	結構	製備根據的實例	外觀
24		WO 2016/109257 實例 1	無色油狀物
25		WO 2016/109257 實例 1	無色油狀物
26		WO 2016/109257 實例 1	白色蠟狀物
27		WO 2016/109257 實例 1	無色油狀物

Cmpd. No.	結構	製備根據的實例	外觀
28		WO 2016/109257 實例 1	白色蠟狀物
29		WO 2016/109257 實例 1	無色油狀物
30		WO 2016/109257 實例 1	無色油狀物
31		WO 2016/109257 實例 1	無色油狀物

Cmpd. No.	結構	製備根據的實例	外觀
32		WO 2016/109257 實例 1	黏稠油狀物
33		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫
34		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫

Cmpd. No.	結構	製備根據的實例	外觀
35		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫
36		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫
37		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫
38		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫

Cmpd. No.	結構	製備根據的實例	外觀
39		WO 2016/109257 實例 1	白色泡沫
40		WO 2016/109257 實例 1	黏稠油狀物
41		WO 2016/109257 實例 1	黏稠油狀物

*Cmpd. No. -- 化合物編號

表 2. 分析資料

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	質譜	NMR
1	IR (薄膜) 2934, 1736, 1644, 1569, 1533, 1480, 1454, 1301, 1207, 1155, 1030, 911, 808, 733 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 507.2 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.31 (s, 1H), 12.64 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.17 (d, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.11 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 6.98 – 6.88 (m, 3H), 6.80 (s, 1H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 5.67 (dq, <i>J</i> = 10.2, 6.1 Hz, 1H), 4.52 – 4.38 (m, 2H), 3.96 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.30 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 1.11 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H).
2	IR (薄膜) 2981, 1737, 1644, 1605, 1570, 1534, 1509, 1479, 1424, 1301, 1220, 1156, 911, 812, 733 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 469.1 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.26 (s, 1H), 12.64 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.29 – 7.18 (m, 6H), 7.16 – 7.08 (m, 1H), 6.96 (t, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 6.76 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 5.76 (dq, <i>J</i> = 10.0, 6.2 Hz, 1H), 4.48 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.05 (d, <i>J</i> = 10.0 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 1.25 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 1.05 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H).
3	IR (薄膜) 2938, 1738, 1623, 1570, 1533, 1506, 1480, 1456, 1299, 1154, 1030, 911, 734 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 547.1 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.28 (s, 1H), 12.66 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.31 – 7.23 (m, 1H), 7.16 (t, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 6.64 – 6.54 (m, 3H), 6.47 (dd, <i>J</i> = 12.1, 2.6 Hz, 1H), 5.77 (dq, <i>J</i> = 12.2, 6.2 Hz, 1H), 4.62 (d, <i>J</i> = 10.3 Hz, 1H), 4.54 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 1.28 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.18 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H).

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	質譜	NMR
4	IR (薄膜) 2938, 1739, 1644, 1570, 1534, 1497, 1424, 1208, 1153, 1032, 911, 809, 732 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 547.1 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.26 (s, 1H), 12.67 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 6.98 – 6.90 (m, 2H), 6.88 – 6.79 (m, 2H), 6.76 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 6.70 (dt, <i>J</i> = 9.0, 3.5 Hz, 1H), 6.65 – 6.59 (m, 1H), 5.84 (dq, <i>J</i> = 12.0, 6.1 Hz, 1H), 4.69 (d, <i>J</i> = 10.4 Hz, 1H), 4.53 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.74 (s, 6H), 1.31 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.15 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H).
5	IR (薄膜) 2937, 1739, 1643, 1570, 1533, 1473, 1424, 1302, 1205, 1154, 1133, 1029, 910, 732 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 588.9 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.15 (s, 1H), 12.70 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.42 – 7.28 (m, 4H), 7.10 (dd, <i>J</i> = 8.4, 2.2 Hz, 1H), 7.06 (dd, <i>J</i> = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.77 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.64 (dq, <i>J</i> = 9.6, 6.2 Hz, 1H), 4.53 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.00 (d, <i>J</i> = 9.5 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 1.27 – 1.20 (m, 6H).
6	IR (薄膜) 2939, 1739, 1644, 1572, 1533, 1484, 1424, 1301, 1244, 1205, 1155, 1062, 910, 733 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 555.0 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.14 (s, 1H), 12.71 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.86 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.35 – 7.27 (m, 2H), 7.07 – 6.93 (m, 4H), 6.77 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.65 (dq, <i>J</i> = 9.4, 6.1 Hz, 1H), 4.53 (p, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 4.03 (d, <i>J</i> = 9.4 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 1.26 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 1.24 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H).
7	IR (薄膜) 2981, 1737, 1643, 1570, 1533, 1479, 1424, 1301, 1205, 1154, 1047, 910, 732 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 547.0 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.23 (d, <i>J</i> = 0.5 Hz, 1H), 12.65 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.84 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.24 (d, <i>J</i> = 8.2 Hz, 1H), 7.16 (d, <i>J</i> = 8.2 Hz, 1H), 7.08 (dd, <i>J</i> = 7.5, 2.2 Hz, 2H), 7.06 – 6.96 (m, 2H), 6.76 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.69 (dq, <i>J</i> = 9.9, 6.1 Hz, 1H), 4.50 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.95 (d, <i>J</i> = 10.1 Hz, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 1.24 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.14 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H).

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	質譜	NMR
8	IR (薄膜) 2968, 1739, 1645, 1595, 1570, 1539, 1488, 1303, 1239, 1205, 1157, 910, 756, 736 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 447.1 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.32 (s, 1H), 12.74 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.20 (dd, <i>J</i> = 8.7, 7.3 Hz, 2H), 6.93 – 6.83 (m, 3H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.11 (dt, <i>J</i> = 9.4, 3.8 Hz, 1H), 4.56 (p, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 4.24 (dd, <i>J</i> = 6.7, 4.4 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 1.98 (dt, <i>J</i> = 13.5, 6.8 Hz, 1H), 1.88 – 1.71 (m, 2H), 1.28 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.03 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 1.01 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.93 (t, <i>J</i> = 7.4 Hz, 3H).
9	IR (薄膜) 1742, 1654, 1575, 1484, 1422, 1304, 1242, 1157, 1059, 911, 734 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 571.0 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 13.63 (s, 1H), 12.49 (d, <i>J</i> = 9.2 Hz, 1H), 7.83 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.32 – 7.26 (m, 2H), 7.17 (dd, <i>J</i> = 8.4, 7.6 Hz, 1H), 7.04 – 6.97 (m, 2H), 6.93 (dd, <i>J</i> = 8.4, 2.2 Hz, 1H), 6.76 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.69 (q, <i>J</i> = 6.3 Hz, 1H), 4.91 (s, 1H), 4.76 (dq, <i>J</i> = 9.3, 7.3 Hz, 1H), 4.00 (s, 3H), 1.48 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.17 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H).
10	IR (薄膜) 2965, 1744, 1644, 1570, 1532, 1481, 1424, 1302, 1240, 1203, 1154, 1028, 944, 911, 755, 736 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 433.1 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.38 (d, <i>J</i> = 0.5 Hz, 1H), 12.85 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 7.87 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.29 – 7.23 (m, 2H), 6.98 – 6.91 (m, 1H), 6.87 (dt, <i>J</i> = 7.9, 1.0 Hz, 2H), 6.77 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.07 (dd, <i>J</i> = 6.3, 5.3 Hz, 1H), 4.76 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.51 (p, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 2.19 – 2.09 (m, 1H), 1.63 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.31 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 0.97 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 0.91 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H).
11	IR (薄膜) 2986, 1741, 1645, 1574, 1465, 1304, 1251, 1158, 1028, 910, 813, 732 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 604.9 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 13.60 (s, 1H), 12.47 (d, <i>J</i> = 9.2 Hz, 1H), 7.81 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.55 (d, <i>J</i> = 2.1 Hz, 1H), 7.33 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz, 1H), 7.29 (d, <i>J</i> = 2.2 Hz, 1H), 7.21 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 1H), 7.10 (dd, <i>J</i> = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 7.01 (dd, <i>J</i> = 8.5, 2.2 Hz, 1H), 6.77 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.67 (q, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.97 (s, 1H), 4.78 (dq, <i>J</i> = 9.3, 7.3 Hz, 1H), 4.00 (s, 3H), 1.49 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H), 1.17 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H).

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	質譜	NMR
12	IR (薄膜) 2941, 1737, 1644, 1570, 1535, 1500, 1475, 1428, 1294, 1027, 1154, 1057, 950, 911, 808, 732 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 583.1 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.21 (s, 1H), 12.66 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.83 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.06 (ddd, <i>J</i> = 8.3, 5.3, 2.1 Hz, 1H), 6.87 – 6.71 (m, 4H), 5.65 (dq, <i>J</i> = 8.4, 6.2 Hz, 1H), 4.85 (d, <i>J</i> = 9.8 Hz, 1H), 4.58 – 4.48 (m, 1H), 4.00 – 3.95 (m, 6H), 3.84 (d, <i>J</i> = 2.0 Hz, 3H), 1.25 (d, <i>J</i> = 5.3 Hz, 3H), 1.24 (d, <i>J</i> = 4.2 Hz, 3H).
13	IR (薄膜) 2983, 1737, 1643, 1570, 1507, 1479, 1453, 1301, 1221, 1157, 1137, 1029, 908, 824, 729, 673 cm ⁻¹	ESIMS <i>m/z</i> 487.1 ([M+H] ⁺)	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.22 (s, 1H), 12.65 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.26 – 7.16 (m, 4H), 6.97 (t, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 6.91 (t, <i>J</i> = 8.7 Hz, 2H), 6.76 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.70 (dq, <i>J</i> = 9.8, 6.1 Hz, 1H), 4.50 (p, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 4.05 (d, <i>J</i> = 9.8 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 1.24 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 1.14 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 170.97, 165.41, 162.70, 162.53, 160.74, 160.57, 152.49, 149.36, 136.93, 136.90, 136.80, 136.77, 130.86, 129.53, 129.50, 129.47, 129.44, 123.60, 115.78, 115.61, 115.37, 115.20, 107.63, 73.21, 56.53, 56.09, 48.66, 19.04, 17.14.
14	IR (薄膜) 2936, 1738, 1595, 1573, 1481, 1296, 1154, 1067, 736 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₉ H ₃₅ N ₂ O ₈ 之計 算值, 539.2388; 實驗值, 539.2409	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 14.30 (s, 1H), 12.62 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 6.72 – 6.57 (m, 5H), 6.57 – 6.40 (m, 2H), 5.79 – 5.68 (m, 1H), 4.49 (t, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 1.36 – 1.18 (m, 3H), 1.07 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H).

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	質譜	NMR
15	IR (薄膜) 2937, 1737, 1571, 1481, 1302, 1209, 1029, 733 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₉ H ₃₅ N ₂ O ₆ 之計 算值, 507.2490; 實驗值, 507.2519	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 14.32 (s, 1H), 12.60 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.91 – 7.81 (m, 1H), 7.01 (q, <i>J</i> = 4.8, 4.1 Hz, 5H), 6.93 (d, <i>J</i> = 8.2 Hz, 1H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 5.75 (dq, <i>J</i> = 10.2, 6.1 Hz, 1H), 4.48 (p, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.91 (d, <i>J</i> = 10.4 Hz, 1H), 2.20 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 1.24 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.05 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.08, 165.31, 152.56, 149.28, 139.27, 139.09, 136.80, 136.33, 134.95, 134.50, 130.87, 129.91, 129.54, 129.36, 129.24, 125.32, 125.07, 123.79, 107.61, 73.64, 57.13, 56.50, 48.64, 19.86, 19.76, 19.28, 19.24, 19.20, 17.15.
16	IR (薄膜) 2942, 1738, 1499, 1224, 1048, 735 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₉ H ₃₅ N ₂ O ₁₀ 之 計算值, 571.2286; 實驗 值, 571.2322	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 14.34 (s, 1H), 12.59 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.85 (dd, <i>J</i> = 7.2, 3.2 Hz, 1H), 7.04 (d, <i>J</i> = 3.0 Hz, 1H), 6.89 (s, 1H), 6.81 – 6.72 (m, 2H), 6.71 – 6.64 (m, 2H), 6.61 (dd, <i>J</i> = 8.8, 3.0 Hz, 1H), 5.94 (dq, <i>J</i> = 10.3, 6.1 Hz, 1H), 4.91 (d, <i>J</i> = 10.1 Hz, 1H), 4.50 (p, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 3.96 (d, <i>J</i> = 3.4 Hz, 3H), 3.81 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 3.71 (s, 6H), 1.25 (d, <i>J</i> = 6.7 Hz, 3H), 1.09 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H).
17	IR (薄膜) 2933, 1737, 1533, 1501, 1239, 1118, 731 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₇ H ₂₉ F ₂ N ₂ O ₆ 之 計算值, 515.1988; 實驗 值, 515.2023	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 14.25 (s, 1H), 12.63 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.86 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.04 (td, <i>J</i> = 6.9, 3.7 Hz, 4H), 6.90 (dd, <i>J</i> = 10.2, 7.8 Hz, 1H), 6.87 – 6.80 (m, 1H), 6.76 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.67 (dq, <i>J</i> = 10.0, 6.0 Hz, 1H), 4.49 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.94 (d, <i>J</i> = 10.4 Hz, 1H), 2.23 (d, <i>J</i> = 1.9 Hz, 3H), 2.20 – 2.17 (m, 3H), 1.23 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.12 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -119.99, -120.53.

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	質譜	NMR
18	IR (薄膜) 2935, 1736, 1572, 1455, 1208, 1154, 1137, 1035, 732 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₉ H ₃₅ N ₂ O ₈ 之計 算值, 539.2388; 實驗值, 539.2419	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 14.28 (s, 1H), 12.61 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.02 (d, <i>J</i> = 7.7 Hz, 1H), 6.94 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 6.81 – 6.66 (m, 6H), 5.79 (dq, <i>J</i> = 12.3, 6.1 Hz, 1H), 4.49 (p, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 2.13 (s, 3H), 2.09 (s, 3H), 1.26 (t, <i>J</i> = 3.1 Hz, 3H), 1.07 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.14, 165.33, 157.85, 157.61, 152.56, 149.31, 140.43, 140.23, 130.83, 130.75, 130.42, 125.21, 124.75, 119.76, 119.54, 109.77, 109.73, 107.62, 73.39, 57.91, 56.50, 55.29, 55.25, 48.69, 29.30, 19.22, 17.16, 15.80, 15.70.
19	IR (薄膜) 2933, 1737, 1571, 1506, 1423, 1206, 1155, 733 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₇ H ₂₉ F ₂ N ₂ O ₆ 之 計算值, 515.1988; 實驗 值, 515.1983	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 14.23 (s, 1H), 12.65 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.87 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.06 (dt, <i>J</i> = 21.0, 7.9 Hz, 2H), 6.99 – 6.83 (m, 5H), 6.77 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 5.68 (dq, <i>J</i> = 9.9, 6.1 Hz, 1H), 4.51 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 2.20 (d, <i>J</i> = 1.8 Hz, 3H), 2.16 (d, <i>J</i> = 1.8 Hz, 3H), 1.24 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.16 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -116.62, -117.26.

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	質譜	NMR
20	IR (薄膜) 2935, 1737, 1571, 1504, 1247, 1211, 1031, 734 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₉ H ₃₅ N ₂ O ₈ 之計 算值, 539.2388; 實驗值, 539.2405	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 14.32 (s, 1H), 12.62 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.10 – 6.98 (m, 4H), 6.79 – 6.64 (m, 3H), 5.69 (dq, <i>J</i> = 10.4, 6.2 Hz, 1H), 4.49 (h, <i>J</i> = 7.4 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.87 (d, <i>J</i> = 10.3 Hz, 1H), 3.77 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 2.10 (s, 3H), 1.23 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.08 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (101 MHz, CDCl ₃) δ 171.12, 165.35, 156.53, 156.28, 152.56, 149.29, 133.74, 133.55, 130.86, 130.52, 130.34, 126.82, 126.31, 126.07, 125.57, 123.77, 110.06, 109.85, 107.61, 77.23, 73.77, 56.49, 56.25, 55.29, 48.69, 19.22, 17.21, 16.33, 16.20.
21	IR (薄膜) 2940, 1738, 1516, 1427, 1284, 1208, 755, 732 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₅ H ₂₃ F ₄ N ₂ O ₆ 之 計算值, 523.1487; 實驗 值, 523.1479	¹ H NMR (400 MHz, CDCl ₃) δ 14.15 (s, 1H), 12.69 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.87 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.16 – 6.91 (m, 6H), 6.78 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.63 (dq, <i>J</i> = 9.4, 6.2 Hz, 1H), 4.53 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.00 (d, <i>J</i> = 9.5 Hz, 1H), 3.98 (s, 3H), 1.24 (app t, <i>J</i> = 6.8 Hz, 6H). ¹⁹ F NMR (376 MHz, CDCl ₃) δ -136.29 (d, <i>J</i> = 21.1 Hz), -136.90 (d, <i>J</i> = 21.1 Hz), -139.33 (d, <i>J</i> = 21.2 Hz), -139.70 (d, <i>J</i> = 21.5 Hz).
22	IR (薄膜) 2982, 1738, 1571, 1481, 1453, 1245, 1157 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₆ H ₂₈ FN ₂ O ₆ 之 計算值, 483.1926; 實驗 值, 483.1968	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.27 (s, 1H), 12.61 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.86 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.30 (dd, <i>J</i> = 8.7, 5.7 Hz, 1H), 7.26 – 7.22 (m, 2H), 7.18 (dd, <i>J</i> = 8.5, 6.9 Hz, 2H), 7.12 – 7.06 (m, 1H), 6.91 – 6.81 (m, 2H), 6.76 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.76 (dq, <i>J</i> = 10.3, 6.1 Hz, 1H), 4.52 – 4.43 (m, 1H), 4.29 (d, <i>J</i> = 10.4 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 1.27 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.05 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -116.71.

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	質譜	NMR
23	IR (薄膜) 2939, 1737, 1572, 1502, 1481, 1208, 734 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₇ H ₂₉ F ₂ N ₂ O ₇ 之 計算值, 531.1937; 實驗 值, 531.1984	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.27 (s, 1H), 12.62 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.84 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.23 (dd, <i>J</i> = 8.5, 6.6 Hz, 1H), 7.10 - 6.99 (m, 2H), 6.87 (t, <i>J</i> = 9.3 Hz, 1H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 6.56 (td, <i>J</i> = 8.3, 2.5 Hz, 1H), 6.47 (dd, <i>J</i> = 10.9, 2.5 Hz, 1H), 5.74 (dq, <i>J</i> = 10.3, 6.1 Hz, 1H), 4.54 - 4.45 (m, 1H), 4.43 (d, <i>J</i> = 10.3 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.77 (s, 3H), 2.21 (d, <i>J</i> = 2.0 Hz, 3H), 1.21 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.13 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -113.43, -120.41.
24		HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₆ H ₂₇ F ₂ N ₂ O ₇ 之 計算值, 517.1781; 實驗 值, 517.1840	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.25 (s, 1H), 12.62 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.84 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.25 - 7.17 (m, 3H), 6.98 - 6.90 (m, 2H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 6.55 (td, <i>J</i> = 8.3, 2.5 Hz, 1H), 6.47 (dd, <i>J</i> = 10.9, 2.5 Hz, 1H), 5.76 (dq, <i>J</i> = 10.1, 6.2 Hz, 1H), 4.54 - 4.44 (m, 2H), 3.96 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 1.21 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 1.14 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -113.26, -116.12.
25	IR (薄膜) 2981, 1736, 1571, 1479, 1453, 1207, 1154, 730 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₇ H ₃₁ N ₂ O ₆ 之計 算值, 479.2177; 實驗值, 449.2214	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.31 (s, 1H), 12.62 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.20 - 7.12 (m, 1H), 7.11 - 7.07 (m, 5H), 7.02 - 6.97 (m, 1H), 6.94 - 6.89 (m, 1H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.78 (dq, <i>J</i> = 10.4, 6.1 Hz, 1H), 4.53 - 4.42 (m, 1H), 3.98 - 3.94 (m, 4H), 2.30 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 1.24 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.03 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H).
26	IR (薄膜) 2935, 1735, 1510, 1244, 1029, 813, 729 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₇ H ₃₁ N ₂ O ₈ 之計 算值, 511.2075; 實驗值, 511.2128	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.28 (s, 1H), 12.61 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.20 - 7.11 (m, 4H), 6.83 - 6.68 (m, 5H), 5.70 (dq, <i>J</i> = 9.8, 6.1 Hz, 1H), 4.57 - 4.38 (m, 1H), 3.96 (s, 4H), 3.75 (s, 3H), 3.72 (s, 3H), 1.23 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 1.11 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H).

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	質譜	NMR
27	IR (薄膜) 2984, 1737, 1571, 1481, 1303, 1223, 1156, 702 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₆ H ₂₉ N ₂ O ₆ 之計 算值, 465.2020; 實驗值, 465.2064	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.29 (s, 1H), 12.71 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.86 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.34 - 7.08 (m, 10H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 5.86 (q, <i>J</i> = 6.2 Hz, 1H), 4.61 - 4.52 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 1.74 (s, 3H), 1.21 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.16 (d, <i>J</i> = 6.3 Hz, 3H).
28	IR (薄膜) 2982, 1737, 1634, 1571, 1480, 1453, 1209, 1155, 730 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₇ H ₃₀ FN ₂ O ₆ 之 計算值, 497.2082; 實驗 值, 497.2118	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.29 (s, 1H), 12.64 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.86 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.22 (t, <i>J</i> = 7.9 Hz, 1H), 7.16 (d, <i>J</i> = 8.1 Hz, 2H), 7.07 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.86 - 6.83 (m, 1H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 6.74 - 6.69 (m, 1H), 5.83 - 5.72 (m, 1H), 4.56 - 4.48 (m, 1H), 4.37 (d, <i>J</i> = 10.3 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 1.25 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.12 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -119.19.
29	IR (薄膜) 2982, 1738, 1571, 1481, 1222, 1158, 735 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₆ H ₂₇ F ₂ N ₂ O ₆ 之 計算值, 501.1832; 實驗 值, 501.1854	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.23 (d, <i>J</i> = 0.5 Hz, 1H), 12.64 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 7.86 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.26 - 7.18 (m, 3H), 6.92 - 6.82 (m, 4H), 6.77 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.70 (dq, <i>J</i> = 9.9, 6.1 Hz, 1H), 4.54 - 4.43 (m, 1H), 4.27 (d, <i>J</i> = 10.2 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.27 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 1.15 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -116.00, -116.39.
30	IR (薄膜) 2937, 1736, 1571, 1491, 1462, 1245, 1029, 756 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₇ H ₃₁ N ₂ O ₈ 之計 算值, 511.2075; 實驗值, 511.2116	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.34 (s, 1H), 12.60 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.84 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.44 (dd, <i>J</i> = 7.6, 1.7 Hz, 1H), 7.26 - 7.23 (m, 1H), 7.15 - 7.03 (m, 2H), 6.84 - 6.80 (m, 3H), 6.74 (dd, <i>J</i> = 7.9, 1.5 Hz, 2H), 5.95 (dq, <i>J</i> = 10.0, 6.2 Hz, 1H), 4.98 (dd, <i>J</i> = 9.8, 2.3 Hz, 1H), 4.57 - 4.46 (m, 1H), 3.95 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 1.24 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 1.05 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H).

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	質譜	NMR
31	IR (薄膜) 2983, 1737, 1571, 1503, 1453, 1207, 1156 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₆ H ₂₈ N ₂ O ₆ 之計 算值, 483.1926; 實驗值, 483.1976	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.27 (s, 1H), 12.62 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.29 – 7.02 (m, 7H), 6.94 – 6.85 (m, 1H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 5.75 (dq, <i>J</i> = 10.2, 6.2 Hz, 1H), 4.53 – 4.42 (m, 1H), 3.99 (d, <i>J</i> = 10.3 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 2.22 (d, <i>J</i> = 1.9 Hz, 3H), 1.24 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.03 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹⁹ F NMR (471 MHz, CDCl ₃) δ -120.17
32	IR (薄膜) 2981, 1736, 1713, 1644, 1598, 1571, 1535, 1500, 1426, 1221, 1161, 1041, 911, 735 cm ⁻¹		¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.31 (s, 1H), 12.64 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz, 1H), 7.84 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.31 (dd, <i>J</i> = 8.6, 6.8 Hz, 1H), 7.20 – 7.12 (m, 1H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 6.55 – 6.49 (m, 3H), 6.43 (dd, <i>J</i> = 11.0, 2.6 Hz, 1H), 5.95 – 5.88 (m, 1H), 4.79 (d, <i>J</i> = 10.2 Hz, 1H), 4.50 (p, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 4.03 – 3.89 (m, 7H), 3.85 (dq, <i>J</i> = 9.0, 7.0 Hz, 1H), 1.47 (t, <i>J</i> = 7.0 Hz, 3H), 1.40 (t, <i>J</i> = 6.9 Hz, 3H), 1.23 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 1.15 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.12, 165.38, 157.59, 152.50, 149.29, 148.38, 130.82, 107.58, 63.80, 56.51, 48.75, 29.28, 14.62.
33	IR (薄膜) 2981, 1739, 1644, 1571, 1533, 1480, 1453, 1425, 1302, 1208, 1155, 1029, 730 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₆ H ₂₈ FN ₂ O ₆ 之 計算值, 483.1926; 實驗 值, 483.1939	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.28 (d, <i>J</i> = 0.5 Hz, 1H), 12.67 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.86 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.32 – 7.16 (m, 6H), 6.86 (dd, <i>J</i> = 8.2, 1.5 Hz, 1H), 6.79 – 6.68 (m, 2H), 5.85 – 5.73 (m, 1H), 4.53 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.41 (d, <i>J</i> = 10.2 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 1.26 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.12 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.01, 165.36, 160.53 (d, <i>J</i> = 245.0 Hz), 152.50, 149.22, 140.36, 130.87, 128.74, 128.30, 126.97, 124.80, 123.73, 115.89 (d, <i>J</i> = 22.6 Hz), 107.58, 72.81, 56.50, 49.19, 48.55, 29.28, 20.83, 19.11, 17.17.

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	質譜	NMR
34	IR (薄膜) 2939, 1736, 1642, 1569, 1531, 1479, 1451, 1423, 1298, 1206, 1153, 1066, 1013, 796, 728 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₅ H ₂₅ Cl ₂ N ₂ O ₆ 之 計算值, 519.1084; 實驗 值, 519.1081	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.21 (s, 1H), 12.66 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.28 – 7.21 (m, 6H), 7.21 – 7.13 (m, 2H), 6.76 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.70 (dq, <i>J</i> = 9.7, 6.2 Hz, 1H), 4.50 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.03 (d, <i>J</i> = 9.7 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 1.24 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 1.16 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 170.93, 165.42, 152.49, 149.36, 139.34, 139.22, 132.99, 132.67, 130.86, 129.40, 129.02, 128.62, 107.64, 72.82, 56.52, 56.30, 48.64, 19.00, 17.19.
35	IR (薄膜) 2982, 1737, 1643, 1588, 1532, 1481, 1448, 1424, 1301, 1205, 1149, 1028, 950, 755, 728 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+Na] ⁺ C ₂₅ H ₂₄ F ₂ N ₂ O ₆ Na 之計算值, 509.1495; 實驗 值, 509.1489	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.21 (d, <i>J</i> = 0.5 Hz, 1H), 12.67 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.86 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.26 (s, 2H), 7.10 – 7.04 (m, 2H), 6.96 (tt, <i>J</i> = 9.8, 2.1 Hz, 2H), 6.93 – 6.89 (m, 1H), 6.84 (tdd, <i>J</i> = 8.4, 2.6, 0.9 Hz, 1H), 6.76 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.73 (dq, <i>J</i> = 9.9, 6.2 Hz, 1H), 4.51 (p, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 4.05 (d, <i>J</i> = 9.9 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 1.34 – 1.22 (m, 3H), 1.14 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 170.90, 165.38, 162.91 (d, <i>J</i> = 246.9 Hz), 162.73 (d, <i>J</i> = 246.3 Hz), 152.50, 149.29, 143.20 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz), 142.95 (d, <i>J</i> = 6.8 Hz), 130.92, 130.41 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz), 130.08 (d, <i>J</i> = 8.5 Hz), 123.69 (d, <i>J</i> = 3.1 Hz), 123.61, 123.40 (d, <i>J</i> = 2.7 Hz), 115.31 (d, <i>J</i> = 20.7 Hz), 114.16 (d, <i>J</i> = 20.9 Hz), 113.81 (d, <i>J</i> = 20.9 Hz), 107.62, 72.88, 57.06, 56.53, 48.55, 29.28, 19.03, 17.19.

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	質譜	NMR
36	IR (薄膜) 2939, 2835, 1736, 1643, 1596, 1570, 1531, 1482, 1451, 1424, 1296, 1206, 1151, 1029, 755, 728 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+Na] ⁺ C ₂₇ H ₃₀ N ₂ O ₈ Na 之 計算值, 533.1894; 實驗 值, 533.1888	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.28 (s, 1H), 12.63 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.20 (t, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 7.13 (t, <i>J</i> = 8.0 Hz, 1H), 6.89 (ddt, <i>J</i> = 7.7, 2.8, 1.2 Hz, 2H), 6.82 (t, <i>J</i> = 2.1 Hz, 2H), 6.78 – 6.69 (m, 2H), 6.65 (ddd, <i>J</i> = 8.2, 2.6, 0.9 Hz, 1H), 5.78 (dq, <i>J</i> = 10.5, 6.1 Hz, 1H), 4.49 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.02 – 3.94 (m, 4H), 3.77 (s, 3H), 3.74 (s, 3H), 1.26 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.08 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.02, 165.32, 159.75, 159.56, 152.52, 149.24, 142.89, 142.61, 130.85, 129.77, 129.40, 123.73, 120.38, 120.08, 114.30, 113.93, 111.85, 107.56, 73.24, 57.91, 56.51, 55.12, 48.60, 19.17, 17.15.
37	IR (薄膜) 2939, 1735, 1643, 1591, 1572, 1487, 1452, 1301, 1245, 1209, 1150, 1027, 727 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₇ H ₂₉ Cl ₂ N ₂ O ₈ 之 計算值, 579.1295; 實驗 值, 579.1298	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.28 (s, 1H), 12.64 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.84 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.31 (d, <i>J</i> = 8.3 Hz, 1H), 7.09 (d, <i>J</i> = 8.2 Hz, 1H), 6.84 – 6.78 (m, 3H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 6.72 (d, <i>J</i> = 2.0 Hz, 1H), 5.87 (dq, <i>J</i> = 9.6, 6.1 Hz, 1H), 4.81 (d, <i>J</i> = 9.7 Hz, 1H), 4.51 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 1.22 (d, <i>J</i> = 6.2 Hz, 3H), 1.16 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.03, 165.37, 157.98, 157.84, 152.49, 149.30, 133.15, 132.79, 130.83, 130.43, 129.91, 127.51 (d, <i>J</i> = 3.3 Hz), 123.66, 120.41, 120.02, 111.62, 111.35, 107.60, 72.33, 56.49, 55.70 (d, <i>J</i> = 6.9 Hz), 48.69, 18.75, 17.29.

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	質譜	NMR
38	IR (薄膜) 2982, 1736, 1643, 1569, 1532, 1508, 1479, 1423, 1218, 1178, 1154, 805, 727 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+H] ⁺ C ₂₆ H ₂₇ F ₂ N ₂ O ₆ 之 計算值, 501.1832; 實驗 值, 501.1847	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.22 (d, <i>J</i> = 0.5 Hz, 1H), 12.66 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.84 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.30 (dd, <i>J</i> = 8.7, 5.8 Hz, 1H), 7.21 – 7.12 (m, 3H), 6.96 (t, <i>J</i> = 8.6 Hz, 1H), 6.86 (td, <i>J</i> = 8.5, 3.0 Hz, 1H), 6.76 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 6.72 (dd, <i>J</i> = 9.7, 2.8 Hz, 1H), 5.67 (dq, <i>J</i> = 10.0, 6.1 Hz, 1H), 4.49 (p, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 4.24 (d, <i>J</i> = 10.0 Hz, 1H), 3.97 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 1.24 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.14 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H).
39	IR (薄膜) 2980, 2937, 1735, 1642, 1568, 1478, 1450, 1422, 1298, 1206, 1153, 1028, 804, 756, 726 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+Na] ⁺ C ₂₇ H ₃₀ N ₂ O ₆ Na 之 計算值, 501.1996; 實驗 值, 501.1987	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.30 (s, 1H), 12.63 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 7.18 – 7.13 (m, 4H), 7.06 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.99 (d, <i>J</i> = 7.8 Hz, 2H), 6.75 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 1H), 5.76 (dq, <i>J</i> = 10.2, 6.1 Hz, 1H), 4.49 (p, <i>J</i> = 7.3 Hz, 1H), 3.98 (d, <i>J</i> = 7.6 Hz, 1H), 3.96 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 1.24 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 3H), 1.07 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H). ¹³ C NMR (126 MHz, CDCl ₃) δ 171.02, 165.31, 152.50, 149.22, 138.69, 138.53, 136.34, 135.99, 130.84, 129.40, 129.02, 127.90, 127.77, 123.77, 107.56, 73.53, 57.04, 56.49, 48.60, 20.96, 20.90, 19.18, 17.15.
40	IR (薄膜) 2939, 1735, 1644, 1571, 1535, 1474, 1425, 1274, 1218, 1154, 1066, 1046, 1003, 726 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+Na] ⁺ C ₂₉ H ₃₄ N ₂ O ₁₀ Na 之計算值, 593.2106; 實驗 值, 593.2100	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.35 (s, 1H), 12.63 (d, <i>J</i> = 6.1 Hz, 1H), 7.86 – 7.79 (m, 1H), 7.06 (dt, <i>J</i> = 8.4, 1.6 Hz, 1H), 7.03 – 6.97 (m, 1H), 6.91 – 6.80 (m, 1H), 6.80 – 6.68 (m, 4H), 5.74 – 5.61 (m, 1H), 5.16 – 5.03 (m, 1H), 4.56 – 4.38 (m, 1H), 3.96 (s, 3H), 3.89 (s, 3H), 3.83 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 1.36 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H), 1.11 (d, <i>J</i> = 7.3 Hz, 3H).

Cmpd. No.	IR (cm ⁻¹)	質譜	NMR
41	IR (薄膜) 2940, 1736, 1643, 1570, 1533, 1493, 1454, 1423, 1243, 1205, 1178, 1152, 1026, 808, 726 cm ⁻¹	HRMS-ESI (<i>m/z</i>) [M+Na] ⁺ C ₂₇ H ₂₈ F ₂ N ₂ O ₈ Na 之計算值, 569.1706; 實驗 值, 569.1700	¹ H NMR (500 MHz, CDCl ₃) δ 14.28 (d, <i>J</i> = 0.5 Hz, 1H), 12.66 (d, <i>J</i> = 7.0 Hz, 1H), 7.85 (d, <i>J</i> = 7.1 Hz, 1H), 7.18 (ddd, <i>J</i> = 17.3, 9.7, 3.1 Hz, 1H), 6.97 – 6.91 (m, 1H), 6.89 – 6.72 (m, 4H), 6.70 (dt, <i>J</i> = 9.0, 4.6 Hz, 1H), 5.93 – 5.79 (m, 1H), 4.85 (d, <i>J</i> = 9.5 Hz, 1H), 4.56 – 4.43 (m, 1H), 3.97 (s, 3H), 3.82 (s, 3H), 3.73 (s, 3H), 1.30 – 1.22 (m, 3H), 1.17 (d, <i>J</i> = 7.2 Hz, 3H).

*Cmpd. No. – 化合物編號

表 3. 生物試驗評級量表

真菌病原體之評級量表	
防治%	評級
> 80	A
≤ 80	B
未測試出	C
在此報告分析中未發現活性	D

表 4. 生物活性 – 在大量及低量的施用中之 PUCCRT 與 SEPTTR 病的防治

Cmpd. No.	在 100 ppm 下的 HV				在 121.5 g/H 下的 LV 活性			
	PUCCRT*		SEPTTR*		PUCCRT*		SEPTTR*	
	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*
1	A	B	A	A	A	B	A	A
2	A	A	A	A	A	A	A	D
3	A	A	A	B	A	B	A	B
4	A	B	B	D	D	D	D	A
5	D	D	A	B	B	D	A	B
6	A	D	A	A	B	D	A	A

Cmpd. No.	在 100 ppm 下的 HV				在 121.5 g/H 下的 LV 活性			
	PUCCRT*		SEPTTR*		PUCCRT*		SEPTTR*	
	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*
7	C	C	C	C	A	B	A	A
8	C	C	C	C	B	A	D	B
9	D	D	A	D	D	D	A	D
10	A	A	B	D	A	A	A	D
11	D	D	A	D	D	D	A	B
12	A	B	A	A	A	B	A	A
13	A	A	A	A	A	B	A	A
14	C	C	C	C	C	C	C	C
15	C	C	C	C	B	B	A	A
16	C	C	C	C	C	C	C	C
17	C	C	C	C	B	B	A	A
18	C	C	C	C	B	B	A	A
19	C	C	C	C	B	B	A	A
20	C	C	C	C	C	C	C	C
21	C	C	C	C	D	B	A	A
22	A	A	A	A	A	A	A	A
23	A	A	A	A	C	C	C	C
24	A	A	A	A	A	B	A	A
25	A	A	A	A	A	A	A	A
26	A	A	A	A	C	C	C	C
27	D	D	A	A	D	D	B	B
28	A	D	A	A	A	B	A	A
29	A	A	A	A	A	B	A	A
30	C	C	C	C	B	B	A	A
31	A	A	A	A	A	B	A	A
32	C	C	C	C	B	D	B	B
33	C	C	C	C	B	D	A	B
34	C	C	C	C	A	D	A	A
35	C	C	C	C	D	D	B	B
36	C	C	C	C	B	D	B	D
37	C	C	C	C	A	D	A	B

Cmpd. No.	在 100 ppm 下的 HV				在 121.5 g/H 下的 LV 活性			
	PUCCRT*		SEPTTR*		PUCCRT*		SEPTTR*	
	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*	1DP*	3DC*
38	C	C	C	C	B	D	A	A
39	C	C	C	C	B	D	A	B
40	C	C	C	C	D	D	D	B
41	C	C	C	C	D	D	B	B

* Cmpd. No. – 化合物編號

* PUCCRT – 小麥褐鏽病 (小麥葉鏽菌)

* SEPTTR – 小麥葉斑病 (小麥葉枯病菌)

* 1DP – 1 天保護劑

* 3DC – 3 天治療劑

* g/H – 克每公頃

* ppm – 百萬分之一

表 5. 生物活性 – 在 25 ppm 下之疾病防治

Cmpd. No.	PHAKPA*	
	1DP*	3DC*
1	A	D
2	B	D
3	D	D
4	B	D
5	D	D
6	D	D
7	D	B
8	B	D
9	D	D
10	A	B
11	D	D
12	B	B

* Cmpd. No. – 化合物編號

* PHAKPA – 亞洲大豆鏽病 (大豆鏽菌)

* 1DP – 1 天保護劑

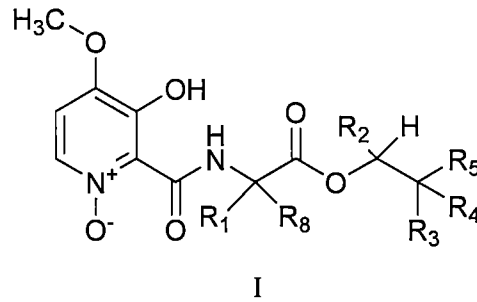
* 3DC – 3 天治療劑

【符號說明】

(無)

申請專利範圍

1. 一種用於防治真菌病原體之組成物，其包含式 I 化合物中之至少一者的混合物，



其中：

R_1 為氫或 $C_1 - C_5$ 烷基，其各自可選地被 0 個、1 個或多個 R_6 取代；

R_2 為氫或 $C_1 - C_5$ 環烷基，其各自可選地被 0 個、1 個或多個 R_6 取代；

R_3 為烷基、環烷基、芳基或雜芳基，其各自可選地被 0 個、1 個或多個 R_6 取代；

R_4 為氫、鹵基、羥基、烷基或烷氧基；

R_5 為烷基、環烷基、芳基、雜芳基、烷氧基、芳氧基或雜芳氧基，其各自可選地被 0 個、1 個或多個 R_6 取代；

R_6 為氫、烷基、芳基、醯基、鹵基、烷氧基或雜環基，其各自可選地被 0 個、1 個或多個 R_7 取代；

R_7 為氫、烷基、芳基、醯基、鹵基、烷氧基或雜環基；且

R_8 為氫或 $C_1 - C_5$ 烷基，其各自可選地被 0 個、1 個或多個 R_6 取代；

以及

一植物學上可接受的載體材料。

2. 如請求項 1 所述之組成物，其中 R_1 及 R_8 獨立地為氫或 $C_1 - C_5$ 烷基。
3. 如請求項 2 所述之組成物，其中 R_2 為 $C_1 - C_5$ 烷基。
4. 如請求項 2 所述之組成物，其中 R_3 及 R_5 係獨立地為芳基，其各自可選地被 0 個、1 個或多個 R_6 取代。
5. 如請求項 2 所述之組成物，其中 R_4 為氫。
6. 如請求項 2 所述之組成物，其中 R_1 及 R_8 獨立地為氫或 $C_1 - C_5$ 烷基， R_2 為 $C_1 - C_5$ 烷基， R_3 及 R_5 獨立地為芳基，各自可選地被 0 個、1 個或多個 R_6 取代，且 R_4 為氫。
7. 如請求項 1 所述之組成物，其中該真菌病原體為下列之其中一者：小麥葉斑病(小麥葉枯病菌(*Zymoseptoria tritici*))、小麥褐銹病(小麥葉鏽菌(*Puccinia triticina*))、條銹病(條形柄鏽菌(*Puccinia striiformis*))、蘋果瘡痂病(蘋果黑星病菌(*Venturia inaequalis*))、玉米黑粉病(玉米黑粉菌(*Ustilago maydis*))、葡萄藤白粉病(葡萄白粉病菌(*Uncinula necator*))、大麥日燒病(大麥雲紋病菌(*Rhynchosporium secalis*))、稻熱病(水稻稻瘟菌(*Pyricularia oryzae*))、大豆銹病(大豆鏽菌(*Phakopsora pachyrhizi*))、小麥穎枯病(穎枯殼小球腔菌(*Leptosphaeria nodorum*))、小麥白粉病(小麥白粉病菌(*Blumeria graminis* f. sp. *tritici*))、大麥白粉病(大麥白粉病菌(*Blumeria graminis* f. sp. *hordei*))、葫蘆科白粉病(二孢白粉菌(*Erysiphe cichoracearum*))、葫蘆科炭疽病(甜瓜炭疽菌(*Colletotrichum lagenarium*))、甜菜葉斑病(甜菜尾孢菌(*Cercospora beticola*))、番茄早疫病(番茄早疫病菌(*Alternaria solani*))及大麥網紋病(圓核腔菌(*Pyrenophora teres*))。

8. 如請求項 6 所述之組成物，其中該真菌病原體為下列之其中一者：小麥葉斑病(小麥葉枯病菌(*Zymoseptoria tritici*))、小麥褐銹病(小麥葉鏽菌(*Puccinia triticina*))、蘋果瘡痂病(蘋果黑星病菌(*Venturia inaequalis*))、大麥日燒病(大麥雲紋病菌(*Rhynchosporium secalis*))、稻熱病(水稻稻瘟菌(*Pyricularia oryzae*))、大豆銹病(大豆鏽菌(*Phakopsora pachyrhizi*))、小麥穎枯病(穎枯殼小球腔菌(*Leptosphaeria nodorum*))、葫蘆科炭疽病(甜瓜炭疽菌(*Colletotrichum lagenarium*))、甜菜葉斑病(甜菜尾孢菌(*Cercospora beticola*))及番茄早疫病(番茄早疫病菌(*Alternaria solani*))。
9. 一種用於防治及預防真菌侵害植物之方法，該方法包含下列步驟：
 - 將一殺真菌有效量之如請求項 6 所述的組成物中之至少一者，施用至植物、鄰近植物的區域、適於支持植物生長的土壤、植物的根部及植物的葉子中之至少一者。