



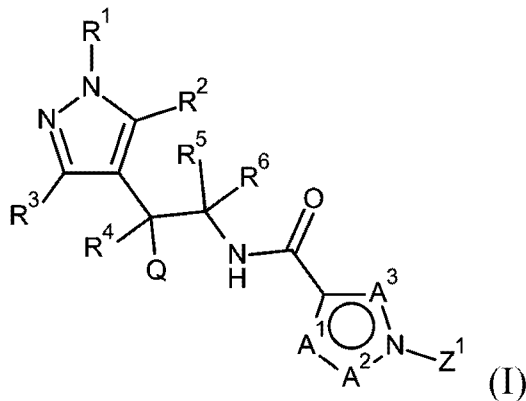
- (21) 申請案號：112136750 (22) 申請日：中華民國 112 (2023) 年 09 月 26 日
- (51) Int. Cl. : C07D401/14 (2006.01) A01N43/647 (2006.01)  
 A01N43/713 (2006.01) A01P3/00 (2006.01)
- (30) 優先權：2022/09/30 印度 202211056322  
 2022/11/18 歐洲專利局 22208396.6
- (71) 申請人：瑞士商先正達農作物保護股份公司 (瑞士) SYNGENTA CROP PROTECTION AG  
 (CH)  
 瑞士
- (72) 發明人：愛德門斯 安德魯 EDMUNDS, ANDREW (GB)；斯卡伯勒 克里斯托佛 查理  
 斯 SCARBOROUGH, CHRISTOPHER CHARLES (US)；瑪哈傑 艾圖爾  
 MAHAJAN, ATUL (IN)
- (74) 代理人：閻啓泰；林景郁
- 申請實體審查：無 申請專利範圍項數：15 項 圖式數：0 共 149 頁

## (54) 名稱

殺微生物之吡唑衍生物

## (57) 摘要

一種具有式 (I) 的化合物：



其中取代基係如在請求項 1 中所定義的，以及那些化合物的農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物和 N-氧化物，其可以用作殺真菌劑。

A compound of formula (I):



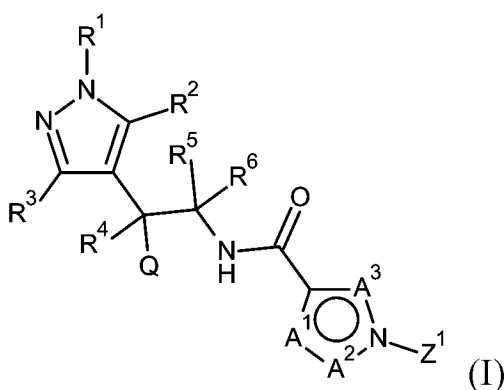
## 【發明摘要】

【中文發明名稱】 殺微生物之吡唑衍生物

【英文發明名稱】 MICROBIOCIDAL PYRAZOLE DERIVATIVES

【中文】

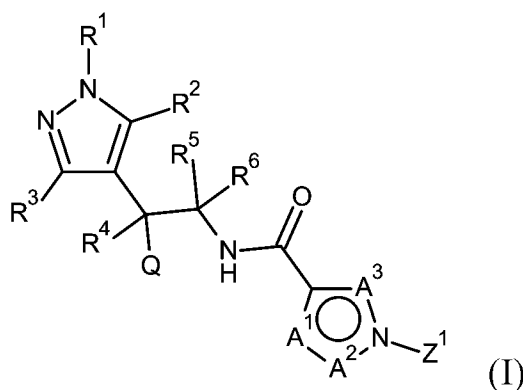
一種具有式 (I) 的化合物：



其中取代基係如在請求項1中所定義的，以及那些化合物的農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物和N-氧化物，其可以用作殺真菌劑。

【英文】

A compound of formula (I):



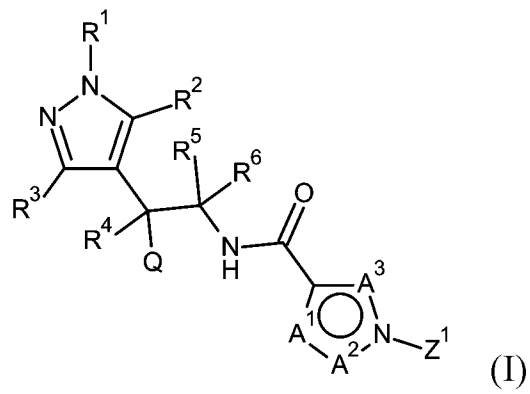
wherein the substituents are as defined in claim 1, and the agrochemically acceptable salts, stereoisomers, enantiomers, tautomers and N-oxides of those compounds, which can be used as fungicides.

【指定代表圖】 無

【代表圖之符號簡單說明】

無

【特徵化學式】



## 【發明說明書】

【中文發明名稱】 殺微生物之吡唑衍生物

【英文發明名稱】 MICROBIOCIDAL PYRAZOLE DERIVATIVES

### 【技術領域】

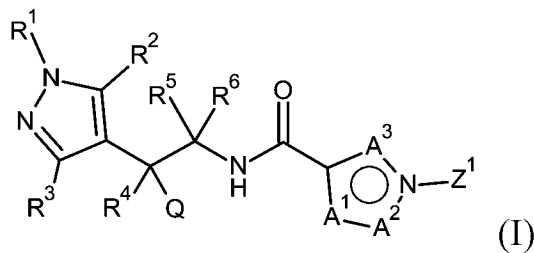
【0001】 本發明關於殺微生物的吡唑衍生物，例如作為活性成分，其具有殺微生物活性、特別是殺真菌活性。本發明還關於該等吡唑衍生物的製備，關於在該等吡唑衍生物的製備中有用的中間體，關於該等中間體的製備，關於包含該等吡唑衍生物中的至少一種的農用化學組成物，關於該等組成物的製備並且關於該等吡唑衍生物或組成物在農業或園藝中用於控制或預防植物、收穫的糧食作物、種子或非生命材料被植物病原性微生物、特別是真菌侵染之用途。

### 【先前技術】

【0002】 無

### 【發明內容】

【0003】 根據本發明之第一方面，提供了一種具有式 (I) 的化合物：



其中

$R^1$  選自氫、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_2$ - $C_4$ 烯基、 $C_2$ - $C_4$ 炔基、或 $C_3$ - $C_6$ 環烷基；

$R^2$  選自氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_2$ - $C_4$ 烯基、 $C_2$ - $C_4$ 炔基、 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基、 $N$ - $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C$ - $C_1$ - $C_4$ 烷基-碳醯亞胺基、 $N$ -羥基- $C$ -

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-碳醯亞胺基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基羰基；

R<sup>3</sup>選自氫、鹵素、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基；

R<sup>4</sup>選自氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基胺基羰基、或二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基胺基)羰基；

R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>獨立地選自氫、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基；

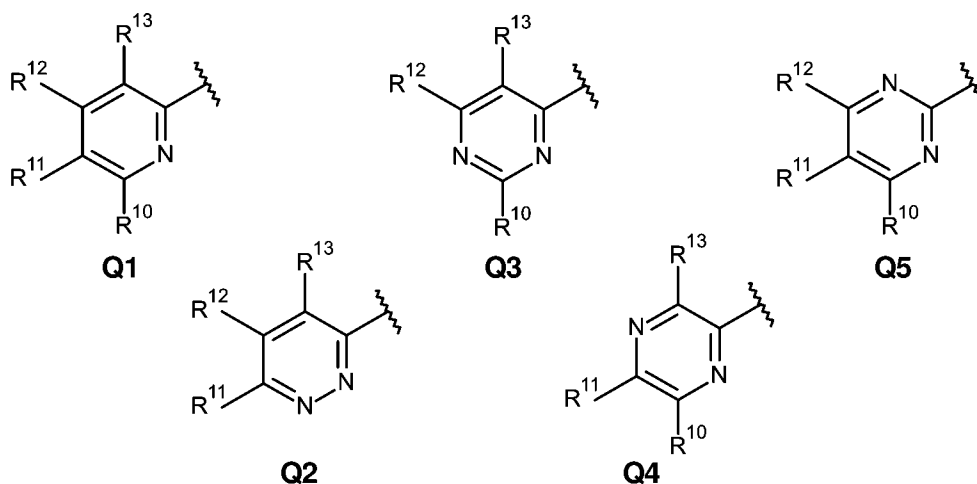
A<sup>1</sup>選自CR<sup>7</sup>或N，

A<sup>2</sup>選自CR<sup>8</sup>或N；

A<sup>3</sup>選自CR<sup>9</sup>或N；

R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>和R<sup>9</sup>獨立地選自氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

Q選自Q1、Q2、Q3、Q4、或Q5；



其中；

R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>獨立地選自氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基氫硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亞磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、N-C<sub>1-4</sub>烷基胺基、N,N-二C<sub>1-4</sub>烷基胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基羰基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-碳醯亞胺基、N-羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-碳醯亞胺基、羥基、三氟甲基磺醯氧基、氰基、羧基、胺基、苯基、5員或6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，其中所述5員或6員

雜芳基包含1、2、3或4個單獨地選自N、O或S的雜原子；並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基中的任一個係未取代的或被1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基；

Z<sup>1</sup>選自C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、苯基、5員或6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，其中所述5員或6員雜芳基中的任一個包含1、2、3或4個單獨地選自N、O或S的雜原子；並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基中的任一個係未取代的或被1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基氫硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亞磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺醯基、或C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基；

或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧化物。

**【0004】** 出人意料地，已經發現，出於實際目的，具有式 (I) 的化合物具有非常有利水平的用於保護植物對抗由真菌引起的病害的生物活性。

**【0005】** 根據本發明之第二方面，提供了一種包含殺真菌有效量的根據本發明之具有式 (I) 的化合物的農用化學組成物。此種農業組成物可以進一步包含至少一種另外的活性成分和/或農用化學上可接受的稀釋劑或載體。

**【0006】** 根據本發明之第三方面，提供了一種控制或預防有用植物被植物病原性微生物侵染之方法，其中將殺真菌有效量的根據本發明之具有式 (I) 的化合物、或包含該具有式 (I) 的化合物的組成物施用於該等植物、其部分或其場所。

**【0007】** 根據本發明之第四方面，提供了根據本發明之具有式 (I) 的化合物作為殺真菌劑之用途。根據本發明之這個特定方面，該用途可以不包括藉由手術或療法來治療人體或動物體之方法以及在人或動物體上實施的診斷方法。

【0008】 具有至少一個鹼性中心的具有式 (I) 的化合物可以例如與以下形成例如酸加成鹽：強無機酸（如礦物酸，例如過氯酸、硫酸、硝酸、亞硝酸、磷酸或氫鹵酸），強有機羧酸（如未取代的或例如被鹵素取代的C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷羧酸，例如乙酸，如飽和或不飽和的二羧酸，例如草酸、丙二酸、琥珀酸、馬來酸、富馬酸或鄰苯二甲酸，如羥基羧酸，例如抗壞血酸、乳酸、蘋果酸、酒石酸或檸檬酸，或如苯甲酸），或有機磺酸（如未取代的或例如被鹵素取代的C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷磺酸或芳基磺酸，例如甲烷磺酸或對甲苯磺酸）。具有至少一個酸性基團的具有式 (I) 的化合物可以例如與鹼形成鹽，例如礦物鹽，如鹼金屬或鹼土金屬鹽，例如鈉鹽、鉀鹽或鎂鹽；或與胺或有機胺（如咪啉，哌啶，吡咯啶，單、二或三低級烷基胺，例如乙胺、二乙胺、三乙胺或二甲基丙基胺，或單、二或三羥基低級烷基胺，例如單乙醇胺、二乙醇胺或三乙醇胺）形成鹽。

【0009】 在每種情況下，根據本發明之具有式 (I) 的化合物呈游離形式、氧化形式（如N-氧化物）、或鹽形式（例如，農藝學上可用的鹽形式）。

【0010】 N-氧化物係三級胺的氧化形式或含氮雜芳香族化合物的氧化形式。例如在A. Albini和S. Pietra的書「Heterocyclic N-oxides [雜環N-氧化物]」, CRC Press [CRC出版社], Boca Raton [波卡拉頓] 1991中描述了它們。

【0011】 根據本發明之具有式 (I) 的化合物還包括在鹽形成期間可能形成的水合物。

【0012】 當取代基被表示為「視需要被取代的」時，這意指它們可以帶有或不帶有一個或多個相同或不同的取代基，例如，一個、兩個或三個R<sup>x</sup>取代基。例如，被1、2或3個鹵素取代的C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基可以包括但不限於-CH<sub>2</sub>Cl、-CHCl<sub>2</sub>、-CCl<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>F、-CHF<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>或-CF<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>基團。作為另一個實例，被1、2或3個鹵素取代的C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基可以包括但不限於CH<sub>2</sub>ClO-、CHCl<sub>2</sub>O-、CCl<sub>3</sub>O-、CH<sub>2</sub>FO-、CHF<sub>2</sub>O-、CF<sub>3</sub>O-、CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>O-或CH<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>O-基團。進一步地，如本文使用



的，術語「視需要被取代的」意指所提到的基團係未取代的或被取代的。

**【0013】** 如本文使用的，術語「鹵素」或「鹵代」是指氟 (fluorine, fluoro)、氯 (chlorine, chloro)、溴 (bromine, bromo) 或碘 (iodine, iodo)，較佳的是氟、氯或溴。這還相應地適用於與其他含義結合的鹵素，如鹵代烷基、鹵代烯基、鹵代炔基、鹵代烷氧基和鹵代環烷基。

**【0014】** 如本文使用的，胺基意指-NH<sub>2</sub>基團。

**【0015】** 如本文使用的，氰基意指-CN基團。

**【0016】** 如本文使用的，術語「羥基 (hydroxyl)」或「羥基 (hydroxy)」意指-OH基團。

**【0017】** 如本文使用的，術語「羧酸」意指-COOH基團。

**【0018】** 如本文使用的，術語「C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷基」是指具有1至n個碳原子、經由任一碳原子附接的飽和直鏈或支鏈烴基，例如以下基團中的任一種：甲基、乙基、正丙基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、正己基、正戊基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基、或1-乙基-2-甲基丙基。

**【0019】** 如本文使用的，術語「C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>-烯基」是指具有從兩個至n個碳原子和一個或兩個雙鍵的直鏈或支鏈烯基鏈部分，例如乙烯基、丙-1-烯基、丁-2-烯基。

**【0020】** 如本文使用的，術語「C<sub>2</sub>-C<sub>n</sub>-炔基」是指具有從兩個至n個碳原子和一個三鍵的直鏈或支鏈炔基鏈部分，例如乙炔基、丙-2-炔基、丁-3-炔基，

**【0021】** 如本文使用的，術語「C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub>-環烷基」是指三(3)至n員環烷基，

如環丙基、環丁基、環戊基和環己基。

**【0022】** 如本文使用的，術語「 $C_1-C_n$ -烷氧基」是指經由氧原子附接的具有一(1)至 $n$ 個碳原子的直鏈或支鏈飽和烷基(如上提及的)，即，例如以下基團中的任一種：甲氧基、乙氧基、正丙氧基、1-甲基乙氧基、正丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基和1,1-二甲基乙氧基。如本文使用的，術語「 $C_2-C_n$ -烯氧基」是指經由氧原子附接的具有二(2)至 $n$ 個碳原子的直鏈或支鏈烯基鏈(如上提及的)。

**【0023】** 如本文使用的，術語「 $C_1-C_n$ -鹵代烷基」是指具有1至 $n$ 個碳原子、經由任一碳原子附接的直鏈或支鏈飽和烷基(如上提及的)，其中該等基團中的一些或全部氫原子可以被氟、氯、溴和/或碘替代，即，例如以下中的任一種：氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯氟甲基、二氯氟甲基、氯二氟甲基、2-氟乙基、2-氯乙基、2-溴乙基、2-碘乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2,2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基、2-氟丙基、3-氟丙基、2,2-二氟丙基、2,3-二氟丙基、2-氯丙基、3-氯丙基、2,3-二氯丙基、2-溴丙基、3-溴丙基、3,3,3-三氟丙基、3,3,3-三氯丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、七氟丙基、1-(氟甲基)-2-氟乙基、1-(氯甲基)-2-氯乙基、1-(溴甲基)-2-溴乙基、4-氟丁基、4-氯丁基、4-溴丁基或九氟丁基。相應地，術語「 $C_1-C_2$ 氟烷基」將是指帶有1、2、3、4、或5個氟原子的 $C_1-C_2$ 烷基，例如以下中的任一種：二氟甲基、三氟甲基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-三氟乙基、1,1,2,2-四氟乙基或五氟乙基。類似地，如本文使用的，術語「 $C_2-C_n$ -鹵代烯基」或「 $C_2-C_n$ -鹵代炔基」分別是指被一個或多個可以相同或不同的鹵素原子取代的 $C_2-C_n$ -烯基或 $C_2-C_n$ -炔基。類似地，如本文使用的，術語「 $C_3-C_n$ -鹵代環烷基」或「 $C_1-C_n$ -鹵代烷氧基」分別是指被一個或多個可以相同或不同的鹵素原子取代的 $C_3-C_n$ -環烷基或 $C_1-C_n$ -烷氧基。

【0024】 如本文使用的，術語「C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷基硫基」或「C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烯基氫硫基」是指藉由硫原子連接的C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷基。

【0025】 如本文使用的，術語「C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷基亞磺醯基」是指藉由亞磺醯基（或S(=O)-）基團的硫原子連接的C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>烷基。

【0026】 如本文使用的，術語「C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷基磺醯基」是指藉由磺醯基（或S(=O)<sub>2</sub>-）基團的硫原子連接的C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>烷基。

【0027】 如本文使用的，術語「C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷基羰基」是指藉由羰基（C=O）基團的碳原子連接的C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷基。

【0028】 如本文使用的，術語「C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷氧基羰基」是指藉由羰基（或C=O）基團的碳原子連接的C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷氧基部分。

【0029】 如本文使用的，術語「C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷氧基羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基」是指被C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷氧基羰基取代的C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷基。

【0030】 如本文使用的，術語「苯甲醯基」是指藉由羰基（C=O）基團的碳原子連接的苯基。

【0031】 如本文使用的，術語「C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷基胺基羰基」是指藉由羰基（C=O）基團的碳原子連接的C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷基胺基（或R<sub>a</sub>NHC(=O)-，其中R<sub>a</sub>係C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷基）。

【0032】 如本文使用的，術語「N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-碳醯亞胺基」是指具有式-C(R<sub>a</sub>)=NO(R<sub>b</sub>)的基團，其中R<sub>a</sub>係如上通常定義的C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基，並且R<sub>b</sub>係如上通常定義的C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基。

【0033】 如本文使用的，術語「N-羥基-C-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-碳醯亞胺基」是指具有式-C(R<sub>a</sub>)=NOH的基團，其中R<sub>a</sub>係如上通常定義的C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基。

【0034】 如本文使用的，術語「雜芳基」是指包含1、2、3或4個單獨地選自N、O或S的雜原子的5員或6員芳香族單環基團。雜芳基的實例包括但不限於呋喃基、吡咯基、噻吩基、吡啶基、咪唑基、噻唑基、異噻唑基、噁唑基、異噁唑

基、三唑基、四唑基、吡啶基、嘧啶基、咪唑基、或吡啶基。術語「雜芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷基」或「雜芳基-C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub>-環烷基」是指分別被雜芳基取代的C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷基或C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub>-環烷基。雜芳基-C<sub>1</sub>-C<sub>n</sub>-烷基或雜芳基-C<sub>3</sub>-C<sub>n</sub>-環烷基可以視情況而定在雜芳基、烷基和/或環烷基上被取代。

**【0035】** 如本文使用的，術語「控制」是指減少有害生物的數量、消除有害生物和/或預防進一步的有害生物損害，使得減少對植物或對植物衍生產品的損害。

**【0036】** 如本文使用的，術語「有害生物」是指在農業、園藝、林業、植物來源的產品（如果實、穀粒和木材）的儲存中存在的昆蟲和軟體動物；以及那些與人造結構的損壞有關的有害生物。術語有害生物涵蓋有害生物的生命週期的所有階段。

**【0037】** 如本文使用的，術語「有效量」是指化合物或其鹽的量，該量在單次或多次施用時提供了希望的效果。

**【0038】** 有效量由熟悉該項技術者使用已知技術並藉由觀察在類似情況下獲得的結果來容易地確定。在確定有效量時，考慮了許多因素，包括但不限於要施用的植物或衍生產品的類型；要控制的有害生物及其生命週期；所施用的特定化合物；施用類型；和其他相關情況。

**【0039】** 如本文使用的，術語「室溫」或「RT」或「rt」是指約15°C至約35°C的溫度。例如，rt可以是指約20°C至約30°C的溫度。

**【0040】** 以下清單提供了關於本發明之具有式 (I) 的化合物的取代基R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、Q（Q1、Q2、Q3、Q4和Q5）和Z<sup>1</sup>的定義，包括較佳的定義。對於該等取代基中的任何一個，以下給出的任何定義都可以結合以下或在本文檔中的其他地方給出的任何其他取代基的任何定義。

【0041】 在本發明之實施方式中， $R^1$ 選自 $C_1$ - $C_4$ 烷基。較佳的是， $R^1$ 係甲基、乙基或異丙基。更較佳的是， $R^1$ 係甲基。

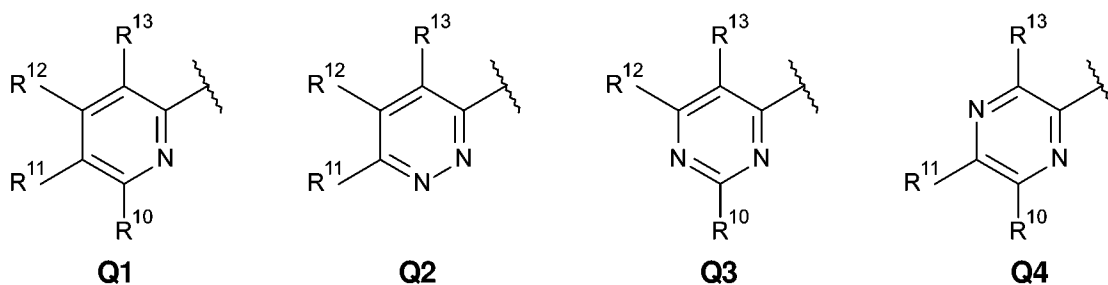
【0042】 在本發明之實施方式中， $R^2$ 選自氫、鹵素、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $C_1$ - $C_2$ 烷基羰基、 $N$ - $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C$ - $C_1$ - $C_2$ 烷基-碳醯亞胺基、或 $N$ -羥基- $C$ - $C_1$ - $C_2$ 烷基-碳醯亞胺基。較佳的是， $R^2$ 選自氫、鹵素、甲基、乙基、環丙基、 $C_1$ - $C_2$ -烷基羰基、 $N$ - $C_1$ - $C_2$ 烷氧基- $C$ - $C_1$ - $C_2$ 烷基-碳醯亞胺基、或 $N$ -羥基- $C_1$ - $C_2$ 烷基-碳醯亞胺基。更較佳的是， $R^2$ 選自氫、氟、氯、溴、甲基、乙基、環丙基、乙醯基、 $-C(CH_3)=NOCH_3$ 、 $-C(CH_3)=NOCH_2CH_3$ 、或 $-C(CH_3)=NOH$ 。甚至更較佳的是， $R^2$ 選自氫、氟、氯、或甲基。

【0043】 在本發明之實施方式中， $R^3$ 選自氫、鹵素、或 $C_1$ - $C_2$ 烷基。較佳的是， $R^3$ 係氫、氟、氯、或甲基。更較佳的是， $R^3$ 係氫或甲基。甚至更較佳的是， $R^3$ 係氫。

【0044】 在本發明之實施方式中， $R^4$ 係氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、氰基、 $C_1$ - $C_4$ -烷基羰基、或 $C_1$ - $C_4$ -烷氧基羰基。較佳的是， $R^4$ 係氫、氯、氟、 $C_1$ - $C_3$ -烷基、氰基、或 $CO_2Me$ 。更較佳的是， $R^4$ 係氫、甲基、乙基、異丙基、或氰基。甚至更較佳的是， $R^4$ 係氫或甲基。在一個實施方式中， $R^4$ 係氫。在另一個實施方式中， $R^4$ 係甲基。

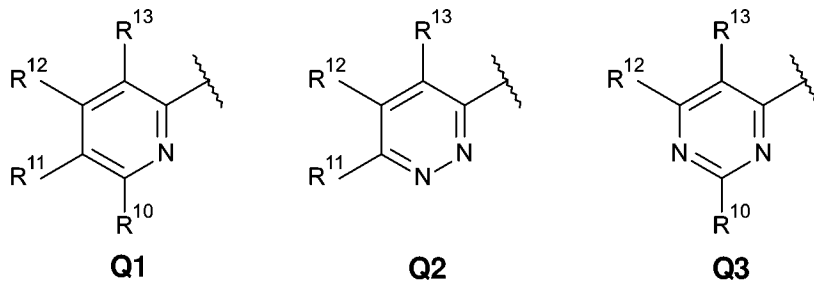
【0045】 在本發明之實施方式中， $R^5$ 和 $R^6$ 獨立地選自氫或 $C_1$ - $C_2$ -烷基。較佳的是， $R^5$ 和 $R^6$ 獨立地選自氫或甲基。更較佳的是， $R^5$ 和 $R^6$ 係氫。

【0046】 在本發明之實施方式中， $Q$ 選自 $Q1$ 、 $Q2$ 、 $Q3$ 或 $Q4$ ：



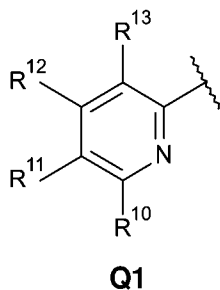
其中 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 係如上所定義的。

較佳的是，Q選自Q1、Q2、或Q3：



其中 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 係如上所定義的。

更較佳的是，Q係Q1：



其中 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 係如上所定義的。

**【0047】** 在本發明之實施方式中， $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 獨立地選自氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、或 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基。較佳的是， $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 獨立地選自氫、氯、溴、氟、或甲基。更較佳的是， $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 係氫。

**【0048】** 在本發明之實施方式中， $R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、鹵素、羥基、氰基、胺基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_2$ - $C_4$ 烯氧基、 $C_2$ - $C_4$ 炔氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基氫硫基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亞磺醯基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺醯基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $N$ - $C_1$ - $C_4$ 烷基胺基、 $N,N$ -二 $C_1$ - $C_4$ 烷基胺基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基、 $N$ - $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基-碳醯亞胺基、 $N$ -羥基- $C_1$ - $C_4$ 烷基-碳醯亞胺基、三氟甲基磺醯氧基、羧基、苯基、5員或6員雜芳基、或 $C_3$ - $C_6$ 環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1、2、3或4個單獨地選自 $N$ 、 $O$ 或 $S$ 的雜原子；並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和 $C_3$ - $C_6$ -環烷基中的任一個係未取代的

或被1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基。

**【0049】** 在本發明之另一個實施方式中，R<sup>10</sup>和R<sup>11</sup>獨立地選自氫、鹵素、氰基、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>鹵代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>烯氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>炔氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基氫硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基亞磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基羰基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷氧基-C-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基-碳醯亞胺基、N-羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基-碳醯亞胺基、羥基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基胺基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基胺基)羰基、三氟甲基磺醯氧基、羧基、苯基、5員或6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1或2個單獨地選自N和O的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基中的任一個係未取代的或被1、2或3個獨立地選自鹵素、氰基、或甲基的取代基取代。

**【0050】** 在較佳的是實施方式中，R<sup>10</sup>和R<sup>11</sup>獨立地選自氫、鹵素、氰基、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>鹵代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>烯氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>炔氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基氫硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基亞磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基羰基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷氧基-C-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基-碳醯亞胺基、N-羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基-碳醯亞胺基、羥基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基胺基羰基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基胺基)羰基、三氟甲基磺醯氧基、羧基、苯基、2-氰基苯基、3-氰基苯基、4-氰基苯基、2-甲基苯基、3-甲基苯基、4-甲基苯基、[4-(三氟甲基)吡啶-1-基]、[3-(三氟甲基)吡啶-1-基]、(3-氰基吡啶-1-基)、(4-氰基吡啶-1-基)、(5-氰基吡啶-1-基)、(4-氰基吡啶-1-基)、(3-氰基吡啶-1-基)、(5-氰基吡啶-1-基)、(4-氰基吡啶-1-基)、(3-氰基吡啶-1-基)、(3,5-二甲基吡啶-1-基)、(5-甲基吡啶-1-基)、(4-甲基吡啶-1-基)、(3-甲基吡啶-1-基)、吡啶-1-基、環丙基、或1-氰基環丙基。

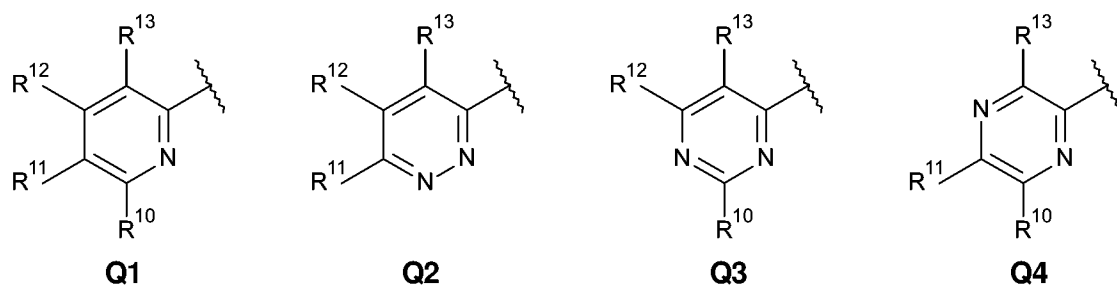
**【0051】** 更較佳的是，R<sup>10</sup>和R<sup>11</sup>獨立地選自氫、氯、氟、溴、甲基、乙基、三氟甲基、二氟甲基、二氟甲氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、甲氧基、

乙氧基、丙氧基、烯丙氧基、丙-2-炔氧基、甲基氫硫基、甲基亞磺醯基、甲基磺醯基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、2-甲氧基-乙氧基甲基、甲氧基羰基、乙氧基羰基、三級丁氧基羰基、乙醯基、丙醯基、 $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NOCH}_3$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NOCH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NOH}$ 、甲基-胺基羰基、二(甲基胺基)羰基、三氟甲基磺醯氧基、氰基、羧基、苯基、2-氰基苯基、3-氰基苯基、4-氰基苯基、2-甲基苯基、3-甲基苯基、4-甲基苯基、[4-(三氟甲基)吡啶-1-基]、[3-(三氟甲基)吡啶-1-基]、(3-氰基吡啶-1-基)、(4-氰基吡啶-1-基)、(5-氰基吡啶-1-基)、(4-氯吡啶-1-基)、(3-氯吡啶-1-基)、(5-氟吡啶-1-基)、(4-氟吡啶-1-基)、(3-氟吡啶-1-基)、(3,5-二甲基吡啶-1-基)、(5-甲基吡啶-1-基)、(4-甲基吡啶-1-基)、(3-甲基吡啶-1-基)、吡啶-1-基、環丙基、或1-氰基環丙基。甚至更較佳的是， $\text{R}^{10}$ 和 $\text{R}^{11}$ 獨立地選自氫、氯、氟、溴、甲基、三氟甲基、二氟甲氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、甲氧基、丙氧基、烯丙氧基、丙-2-炔氧基、甲基氫硫基、甲基亞磺醯基、甲基磺醯基、甲氧基甲基、2-甲氧基乙氧基甲基、甲氧基羰基、乙醯基、丙醯基、 $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NOCH}_3$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NOCH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NOH}$ 、甲基胺基羰基、二(甲基胺基)羰基、三氟甲基-磺醯氧基、氰基、羧基、苯基、2-氰基苯基、3-氰基苯基、4-氰基苯基、[4-(三氟甲基)吡啶-1-基]、[3-(三氟甲基)吡啶-1-基]、(3-氰基吡啶-1-基)、(4-氰基吡啶-1-基)、(5-氯吡啶-1-基)、(4-氯吡啶-1-基)、(3-氯吡啶-1-基)、(5-氟吡啶-1-基)、(4-氟吡啶-1-基)、(3-氟吡啶-1-基)、(3,5-二甲基吡啶-1-基)、(5-甲基吡啶-1-基)、(4-甲基吡啶-1-基)、(3-甲基吡啶-1-基)、吡啶-1-基、環丙基、或1-氰基環丙基。還甚至更較佳的是， $\text{R}^{10}$ 和 $\text{R}^{11}$ 獨立地選自氫、氯、氟、溴、甲氧基、氰基、胺基、羧基、2-氰基苯基、3-氰基苯基、4-氰基苯基、(3-氰基吡啶-1-基)、(4-氰基吡啶-1-基)、(5-氯吡啶-1-基)、(4-氯吡啶-1-基)、(3-氯吡啶-1-基)、(5-氟吡啶-1-基)、(4-氟吡啶-1-基)、(3-氟吡啶-1-基)、(3,5-二甲基吡啶-1-基)、(5-甲基吡啶-1-基)、(4-甲基吡啶-1-基)、(3-甲基吡啶-1-基)、吡啶-1-基、環丙基、以及1-氰基環丙基。



**【0052】** 在本發明之還另一個實施方式中， $R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、鹵素、氰基、胺基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、苯基、5員或6員雜芳基或 $C_3$ - $C_6$ 環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和 $C_3$ - $C_6$ 環烷基中的任一個係未取代的或被1或2個獨立地選自鹵素、氰基、或甲基的取代基取代。更較佳的是， $R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、氯、溴、甲氧基、氰基、胺基、2-氰基苯基、3-氰基苯基、4-氰基苯基、(3-氰基吡啶-1-基)、(4-氰基吡啶-1-基)、(3,5-二甲基吡啶-1-基)、(5-甲基吡啶-1-基)、(4-甲基吡啶-1-基)、(3-甲基吡啶-1-基)、吡啶-1-基、環丙基、以及1-氰基環丙基。甚至更較佳的是， $R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、氯、溴、氰基、或胺基。

**【0053】** 在本發明之實施方式中，Q選自Q1、Q2、Q3、或Q4：

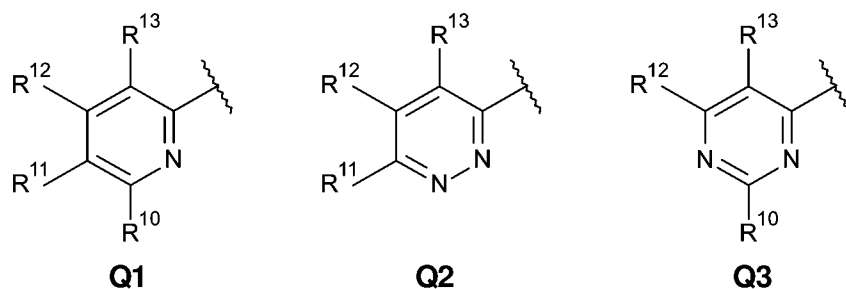


其中

$R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、鹵素、氰基、胺基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、苯基、5員或6員雜芳基、或 $C_3$ - $C_6$ 環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和 $C_3$ - $C_6$ 環烷基中的任一個係未取代的或被1或2個獨立地選自鹵素、氰基、或甲基的取代基取代；並且 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 係氫。

**【0054】** 在本發明之另一個實施方式中，Q選自Q1、Q2、Q3、或Q4；其中 $R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、鹵素、氰基、或胺基；並且 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 係氫。

較佳的是，Q選自Q1、Q2、或Q3：



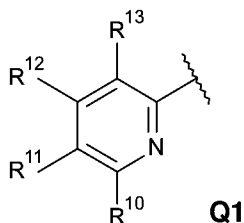
其中

$R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、鹵素、氰基、胺基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、苯基、5員或6員雜芳基、或 $C_3$ - $C_6$ 環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和 $C_3$ - $C_6$ -環烷基中的任一個係未取代的或被1或2個獨立地選自鹵素、氰基、或甲基的取代基取代；並且

$R^{12}$ 和 $R^{13}$ 係氫。

**【0055】** 在本發明之另一個實施方式中，Q選自Q1、Q2、或Q3；其中 $R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、鹵素、氰基、或胺基；並且 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 係氫。

更較佳的是，Q係Q1



其中

$R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、鹵素、氰基、胺基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、苯基、5員或6員雜芳基、或 $C_3$ - $C_6$ 環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和 $C_3$ - $C_6$ -環烷基中的任一個係未取代的或被1或2個獨立地選自鹵素、氰基、或甲基的取代基取代；並且

$R^{12}$ 和 $R^{13}$ 係氫。

**【0056】** 在本發明之另一個實施方式中，Q係Q1；其中 $R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、鹵素、氰基、或胺基；並且 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 係氫。

【0057】 在本發明之實施方式中，A<sup>1</sup>選自CR<sup>7</sup>或N；A<sup>2</sup>選自CR<sup>8</sup>或N；A<sup>3</sup>選自CR<sup>9</sup>或N；其中A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>和A<sup>3</sup>中的至少兩個選自N。較佳的是，在本發明之一個實施方式中，A<sup>1</sup>選自CR<sup>7</sup>；並且A<sup>2</sup>和A<sup>3</sup>係N。較佳的是，在另一個實施方式中，A<sup>1</sup>和A<sup>2</sup>係N；並且A<sup>3</sup>選自CR<sup>9</sup>。較佳的是，在另一個實施方式中，A<sup>1</sup>係N；A<sup>2</sup>係CR<sup>8</sup>，並且A<sup>3</sup>係N。更較佳的是，A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>和A<sup>3</sup>係N。

【0058】 在本發明之另一個實施方式中，A<sup>1</sup>和A<sup>2</sup>係N，並且A<sup>3</sup>係CR<sup>9</sup>。在本發明之還另一個實施方式中，A<sup>1</sup>係CR<sup>7</sup>；A<sup>2</sup>係CR<sup>8</sup>，並且A<sup>3</sup>係N。在本發明之還另一個實施方式中，A<sup>1</sup>係N；A<sup>2</sup>係CR<sup>8</sup>，並且A<sup>3</sup>係CR<sup>9</sup>。在本發明之還另一個實施方式中，A<sup>1</sup>係CR<sup>7</sup>；A<sup>2</sup>係N；並且A<sup>3</sup>係CR<sup>9</sup>。

【0059】 在本發明之實施方式中，R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>和R<sup>9</sup>獨立地選自氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、或C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基。較佳的是，R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>和R<sup>9</sup>獨立地選自氫、鹵素、甲基、或三氟甲基。更較佳的是，R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>和R<sup>9</sup>係氫。

【0060】 在本發明之實施方式中，Z<sup>1</sup>選自C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、苯基、5員至6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基；其中所述5員或6員雜芳基包含1、2、3或4個單獨地選自N、O或S的雜原子，並且其中所述苯基和5員至6員雜芳基中的任一個係未取代的或被1、2或3個獨立地選自以下項的取代基取代：鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基氫硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亞磺醯基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺醯基，並且其中所述C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基係未取代的或被1、2或3個獨立地選自以下項的取代基取代：鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基。

【0061】 在另一個實施方式中，Z<sup>1</sup>選自C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、苯基、5員至6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基；其中所述5員或6員雜芳基包含1、2或3個單獨地選自N、O或S的雜原子，並且其中所述苯基和5員至6員雜芳基中的任一個係未取代的或被1、2或3個獨立地選自氟、氯、甲基、乙基、乙炔基、甲氧基、或甲基磺醯基的

取代基取代，並且其中所述C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基係未取代的或被1或2個選自甲基的取代基取代。

**【0062】** 在另一個實施方式中，Z<sup>1</sup>選自C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、苯基、5員至6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基；其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N、O或S的雜原子，並且其中所述苯基和5員至6員雜芳基中的任一個係未取代的或被1或2個獨立地選自氟、氯、甲基、乙基、乙炔基、甲氧基、或甲基磺醯基的取代基取代，並且其中所述C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基係未取代的或被1或2個選自甲基的取代基取代。

**【0063】** 較佳的是，Z<sup>1</sup>選自1-甲基吡啶-4-基、2,3,4-三氟苯基、2,3-二氟苯基、3,4-二氟苯基、2,4,6-三氟苯基、2,4-二氟苯基、2,5-二氟苯基、3,5-二氟-2-吡啶基、5-氟-2-吡啶基、3-氟-2-吡啶基、2-氟-4-甲氧基-苯基、2-氟-4-甲基磺醯基-苯基、2-氟苯基、3-氟苯基、4-氟苯基、3,5-二氟-2-呋喃基、3-氟-2-呋喃基、5-氟-2-呋喃基、3,5-二氟-2-噻吩基、3-氟-2-噻吩基、5-氟-2-噻吩基、2-甲基苯基、3-甲基苯基、4-甲基苯基、2-氯苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、3-甲氧基苯基、4-乙炔基-2-氟-苯基、4-氟-2-甲氧基-苯基、環丙基、1-甲基環丙基、環丁基、環己基、環戊基、甲基、正丙基、或苯基。更較佳的是，Z<sup>1</sup>選自1-甲基吡啶-4-基、2,4,6-三氟苯基、2,4-二氟苯基、2,5-二氟苯基、2-氯苯基、2-氟苯基、2-呋喃基、2-甲基苯基、2-噻吩基、3,4-二氟苯基、3-氯苯基、3-氟苯基、3-甲基苯基、3-噻吩基、4-氟-2-甲氧基-苯基、4-氟苯基、4-甲基苯基、環丁基、環己基、環戊基、甲基、或苯基。甚至更較佳的是，Z<sup>1</sup>選自1-甲基吡啶-4-基、2,4,6-三氟苯基、3,5-二氟-2-吡啶基、2,4-二氟苯基、2-氟苯基、2-呋喃基、2-甲基苯基、2-噻吩基、3,4-二氟苯基、3-氯苯基、3-噻吩基、4-氟-2-甲氧基-苯基、4-氟苯基、環丁基、環己基、環戊基、或苯基。還甚至更較佳的是，Z<sup>1</sup>選自2,4-二氟苯基、3,5-二氟-2-吡啶基、2-氟苯基、4-氟苯基、或苯基。

**【0064】** 在本發明之另一個實施方式中，Z<sup>1</sup>選自C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、苯基、5員至

6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基；其中所述5員或6員雜芳基包含1、2或3個單獨地選自N、O或S的雜原子，並且其中所述苯基和5員至6員雜芳基係未取代的或被1或2個獨立地選自以下項的取代基取代：鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基，並且其中所述C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基係未取代的或被1個選自鹵素或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基的取代基取代。較佳的是，Z<sup>1</sup>選自苯基或5員至6員雜芳基；其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N或S的雜原子，並且其中所述苯基和5員至6員雜芳基係未取代的或被1或2個獨立地選自氟、氯、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基的取代基取代。更較佳的是，Z<sup>1</sup>選自1-甲基吡啶-4-基、2,4,6-三氟苯基、2,4-二氟苯基、3,5-二氟-2-吡啶基、5-氟-2-吡啶基、3-氟-2-吡啶基、2-氟苯基、3,5-二氟-2-呋喃基、3-氟-2-呋喃基、5-氟-2-呋喃基、3,5-二氟-2-噁吩基、3-氟-2-噁吩基、5-氟-2-噁吩基、2-甲基苯基、2-噁吩基、3,4-二氟苯基、3-氯苯基、3-噁吩基、4-氟-2-甲氧基-苯基、4-氟苯基、環丁基、環己基、環戊基、或甲基。還更較佳的是，Z<sup>1</sup>選自2,4-二氟苯基、3,5-二氟-2-吡啶基、5-氟-2-吡啶基、3-氟-2-吡啶基、3,5-二氟-2-呋喃基、3-氟-2-呋喃基、5-氟-2-呋喃基、3,5-二氟-2-噁吩基、3-氟-2-噁吩基、5-氟-2-噁吩基、2-氟苯基、4-氟苯基、或苯基。

**【0065】** 在本發明之另一個實施方式中，Z<sup>1</sup>選自苯基、5員至6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基；其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N或S的雜原子，並且其中所述苯基和5員至6員雜芳基係未取代的或被1或2個獨立地選自鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基的取代基取代，並且其中所述C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基係未取代的或被1個選自鹵素或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基的取代基取代。較佳的是，Z<sup>1</sup>選自苯基或5員至6員雜芳基；其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N或S的雜原子，並且其中所述苯基和5員至6員雜芳基係未取代的或被1或2個獨立地選自氟、氯、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基的取代基取代。

**【0066】** 因此，本發明使得可獲得具有式 (I) 的化合物，其具有呈所有組

合/每種排列的如上所定義的關於 (I) 的 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 、 $Q$  ( $Q-1$ 、 $Q2$ 、 $Q3$ 、 $Q4$ 和 $Q5$ ) 和 $Z^1$ 。

【0067】 提供了根據本發明之實施方式，如下面列出的。

【0068】 在一個實施方式中，提供了具有式 (I) 的化合物，其中

$R^1$  選自氫、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、或 $C_3$ - $C_6$ 環烷基；

$R^2$  選自氫、鹵素、 $C_1$ - $C_6$ 烷基、 $C_2$ - $C_6$ 烯基、 $C_2$ - $C_6$ 炔基、 $C_1$ - $C_6$ 鹵代烷基、 $C_3$ - $C_6$ 環烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基、 $N$ - $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C$ - $C_1$ - $C_4$ 烷基-碳醯亞胺基、 $N$ -羥基- $C$ - $C_1$ - $C_4$ 烷基-碳醯亞胺基、或 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基；

$R^3$  選自氫、鹵素或 $C_1$ - $C_4$ 烷基；

$R^4$  選自氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基胺基羰基、或二( $C_1$ - $C_4$ 烷基胺基)羰基；

$R^5$ 和 $R^6$ 獨立地選自氫或 $C_1$ - $C_4$ 烷基；

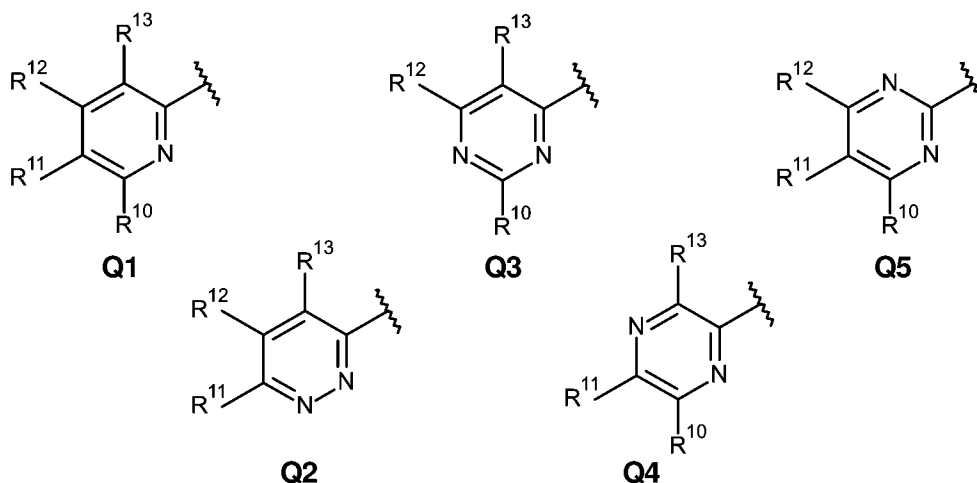
$A^1$  選自 $CR^7$ 或 $N$ ，

$A^2$  選自 $CR^8$ 或 $N$ ；

$A^3$  選自 $CR^9$ 或 $N$ ；

$R^7$ 、 $R^8$ 和 $R^9$ 獨立地選自氫、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_2$ - $C_4$ 烯基、 $C_2$ - $C_4$ 炔基、或 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基；

$Q$  選自 $Q1$ 、 $Q2$ 、 $Q3$ 、 $Q4$ 、或 $Q5$ ；



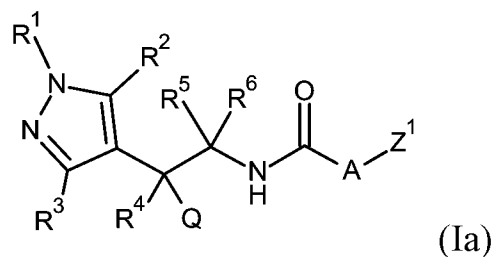
其中；

$R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 和 $R^{13}$ 獨立地選自氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_2$ - $C_4$ 烯氧基、 $C_2$ - $C_4$ 炔氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基氫硫基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亞磺醯基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺醯基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $N$ - $C_1$ - $C_4$ 烷基胺基、 $N,N$ -二 $C_1$ - $C_4$ 烷基胺基、 $C_1$ - $C_6$ 烷氧基羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基羰基、 $N$ - $C_1$ - $C_4$ 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ 烷基-碳醯亞胺基、 $N$ -羥基- $C_1$ - $C_4$ 烷基-碳醯亞胺基、羥基、三氟甲基磺醯氧基、氰基、羧基、胺基、苯基、5員或6員雜芳基、或 $C_3$ - $C_6$ 環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1、2、3或4個單獨地選自 $N$ 、 $O$ 或 $S$ 的雜原子，並且其中所述苯基、5員至6員雜芳基或 $C_3$ - $C_6$ -環烷基中的任一個係未取代的或被1、2或3個獨立地選自鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、或 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基的取代基取代；並且

$Z^1$ 選自 $C_1$ - $C_4$ 烷基、苯基、5員或6員雜芳基、或 $C_3$ - $C_6$ -環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1、2、3或4個單獨地選自 $N$ 、 $O$ 或 $S$ 的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和 $C_3$ - $C_6$ -環烷基中的任一個係未取代的或被1、2或3個獨立地選自鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基氫硫基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基亞磺醯基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基磺醯基、或 $C_2$ - $C_4$ 炔基的取代基取代；

或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或 $N$ -氧化物。

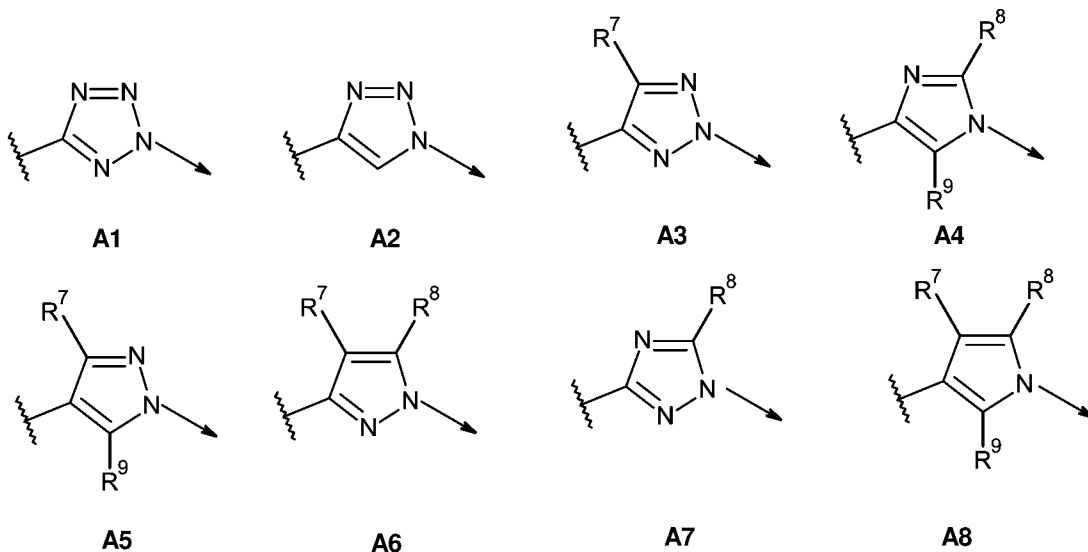
【0069】 在本發明之實施方式中，具有式 (I) 的化合物可以是具有式 (Ia) 的化合物：



其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $Q$  ( $Q_1$ 、 $Q_2$ 、 $Q_3$ 、 $Q_4$ 和 $Q_5$ )、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、

$R^{13}$ 和 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的，並且

A選自由以下組成之群組：



其中 指示至C(=O)基團的鍵並且箭頭指示至 $Z^1$ 基團的鍵，並且 $R^7$ 、 $R^8$ 和

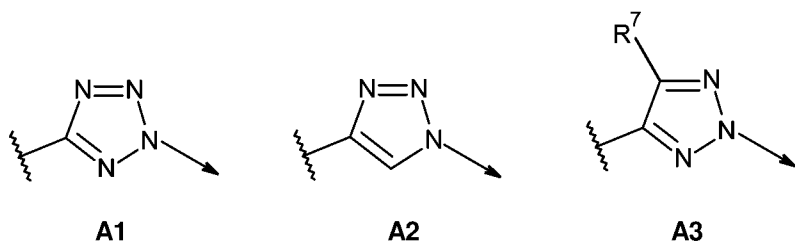
$R^9$ 獨立地選自氫、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_2$ - $C_4$ 烯基、 $C_2$ - $C_4$ 炔基、或 $C_1$ - $C_4$ 鹵代烷基。

較佳的是，在具有式 (Ia) 的化合物中， $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、Q ( $Q_1$ 、 $Q_2$ 、 $Q_3$ 、 $Q_4$ 和 $Q_5$ )、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的，A選自A1、A2、A3、A4、A5、A6、A7、或A9，並且 $R^7$ 、 $R^8$ 和 $R^9$ 係氫、鹵素、甲基、或三氟甲基。

更較佳的是，在具有式 (Ia) 的化合物中， $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、Q ( $Q_1$ 、 $Q_2$ 、 $Q_3$ 、 $Q_4$ 和 $Q_5$ )、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的，A選自A1、A2、A3、A4、A5、A6、A7、或A9，並且 $R^7$ 、 $R^8$ 和 $R^9$ 係氫。

**【0070】** 在本發明之實施方式中，在具有式 (Ia) 的化合物中，其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、Q ( $Q_1$ 、 $Q_2$ 、 $Q_3$ 、 $Q_4$ 和 $Q_5$ )、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的，A選自



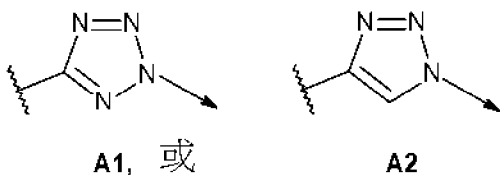


其中 指示至C(=O)基團的鍵並且箭頭指示至Z<sup>1</sup>基團的鍵，並且R<sup>7</sup>選自氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>炔基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基。

較佳的是，在具有式 (Ia) 的化合物中，R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、Q (Q<sub>1</sub>、Q<sub>2</sub>、Q<sub>3</sub>、Q<sub>4</sub>和Q<sub>5</sub>)、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>和Z<sup>1</sup>係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的，A選自A1、A2、或A3，並且R<sup>7</sup>係氫、鹵素、甲基、或三氟甲基。

更較佳的是，在具有式 (Ia) 的化合物中，R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、Q (Q<sub>1</sub>、Q<sub>2</sub>、Q<sub>3</sub>、Q<sub>4</sub>和Q<sub>5</sub>)、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>和Z<sup>1</sup>係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的，A選自A1、A2、或A3，並且R<sup>7</sup>係氫。

**【0071】** 在本發明之另一個實施方式中，在具有式 (Ia) 的化合物中，其中R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、Q (Q<sub>1</sub>、Q<sub>2</sub>、Q<sub>3</sub>、Q<sub>4</sub>和Q<sub>5</sub>)、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>和Z<sup>1</sup>係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的，A選自



其中 指示至C(=O)基團的鍵並且箭頭指示至Z<sup>1</sup>基團的鍵。較佳的是，在具有式 (Ia) 的化合物中，R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、Q (Q<sub>1</sub>、Q<sub>2</sub>、Q<sub>3</sub>、Q<sub>4</sub>和Q<sub>5</sub>)、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>和Z<sup>1</sup>係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的，A選自A1或A2。

更佳的是，在具有式 (Ia) 的化合物中，R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、Q (Q<sub>1</sub>、Q<sub>2</sub>、Q<sub>3</sub>、Q<sub>4</sub>和Q<sub>5</sub>)、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>和Z<sup>1</sup>係如對於根據本發明之具有式 (I) 的

化合物所定義的，A選自A1或A2。

【0072】 在本發明之又另一個實施方式中，在具有式 (Ia) 的化合物中，其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的，

A選自A1或A2；

$R^7$ 係氫；並且

Q選自Q1、Q2、Q3、或Q4。

【0073】 在本發明之還另一個實施方式中，在具有式 (Ia) 的化合物中，其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的，

A選自A1、或A2；

$R^7$ 係氫；並且

Q選自Q1、Q2、或Q3。

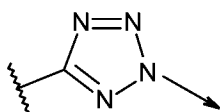
【0074】 在本發明之還另一個實施方式中，在具有式 (Ia) 的化合物中，其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的，

A選自A1、或 A2；


$R^7$ 係氫；並且

Q係Q1。

【0075】 在本發明之實施方式中，在具有式 (Ia) 的化合物中，其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、Q (Q1、Q2、Q3、Q4和Q5)、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的，A選自



A1

其中  指示至C(=O)基團的鍵並且箭頭指示至Z<sup>1</sup>基團的鍵。

**【0076】** 在本發明之另一個實施方式中，在具有式 (Ia) 的化合物中，其中R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>和Z<sup>1</sup>係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的，A選自A1，並且Q選自Q1、Q2、Q3、或Q4。

**【0077】** 在本發明之還另一個實施方式中，在具有式 (Ia) 的化合物中，其中R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>和Z<sup>1</sup>係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的，A選自A1，並且Q選自Q1、Q2、或Q3。

**【0078】** 在本發明之還另一個實施方式中，在具有式 (Ia) 的化合物中，其中R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>和Z<sup>1</sup>係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的，A選自A1，並且Q係Q1。

**【0079】** 較佳的是，在本發明之具有式 (Ia) 的化合物中

R<sup>1</sup>係C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，

R<sup>2</sup>係氫、氟、氯、或甲基；

R<sup>3</sup>係氫或甲基，

R<sup>4</sup>係氫或甲基；

R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>獨立地選自氫或甲基；

A係A1、或A2；

R<sup>7</sup>係氫；

Q係Q1、Q2或Q3；

R<sup>10</sup>和R<sup>11</sup>獨立地選自氫、鹵素、氰基、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、苯基、5員或6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基中的任一個係未取代的或被1或2個獨立地選自鹵素、氰基、或甲基的取代基取代；

R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>獨立地選自氫；並且

Z<sup>1</sup>選自苯基、5員至6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基；其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N或S的雜原子，並且其中所述苯基和5員至6員雜芳基係未取代的或被1或2個獨立地選自鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基的取代基取代，並且其中所述C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基係未取代的或被1個選自鹵素或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基的取代基取代。

【0080】 較佳的是，在本發明之具有式 (Ia) 的化合物中

R<sup>1</sup>係C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，

R<sup>2</sup>係氫、氟、氯、或甲基；

R<sup>3</sup>係氫或甲基，

R<sup>4</sup>係氫或甲基；

R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>獨立地選自氫或甲基；

A係A1、或A2；

R<sup>7</sup>係氫；

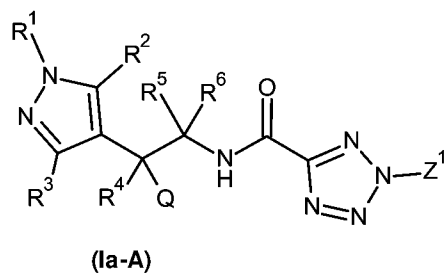
Q係Q1；

R<sup>10</sup>和R<sup>11</sup>獨立地選自氫、鹵素、氰基、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、苯基、5員或6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基中的任一個係未取代的或被1或2個獨立地選自鹵素、氰基或甲基的取代基取代；

R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>選自氫；並且

Z<sup>1</sup>選自苯基、5員至6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基；其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N或S的雜原子，並且其中所述苯基和5員至6員雜芳基係未取代的或被1或2個獨立地選自鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基的取代基取代，並且其中所述C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基係未取代的或被1個選自鹵素或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基的取代基取代。

【0081】 在本發明之實施方式中，具有式 (Ia) 的化合物可以是具有式 (Ia-A) 的化合物，其中A係A1：



其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $Q$  ( $Q_1$ 、 $Q_2$ 、 $Q_3$ 、 $Q_4$ 和 $Q_5$ )、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的。

【0082】 較佳的是，在本發明之具有式 (Ia-A) 的化合物中，

$R^1$ 係 $C_1$ - $C_4$ -烷基，

$R^2$ 係氫、氟、氯、或甲基；

$R^3$ 係氫或甲基，

$R^4$ 係氫或甲基；

$R^5$ 和 $R^6$ 獨立地選自氫或甲基；並且

$Q$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的。

【0083】 在另一個實施方式中，在本發明之具有式 (Ia-A) 的化合物中，

$R^1$ 係 $C_1$ - $C_4$ -烷基，

$R^2$ 係氫、氟、氯、或甲基；

$R^3$ 係氫或甲基，

$R^4$ 係氫或甲基；

$R^5$ 和 $R^6$ 獨立地選自氫或甲基；

$Q$ 係 $Q_1$ 、 $Q_2$ 、或 $Q_3$ ，

$R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、鹵素、氰基、胺基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、苯基、5員或6員雜芳基、或 $C_3$ - $C_6$ 環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N的雜原子，並

第25頁，共 143 頁(發明說明書)

且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基中的任一個係未取代的或被1或2個獨立地選自鹵素、氰基、或甲基的取代基取代；

R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>獨立地選自氫；並且

Z<sup>1</sup>選自苯基或5員至6員雜芳基；其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N或S的雜原子，並且其中所述苯基和5員至6員雜芳基係未取代的或被1或2個獨立地選自氟、氯、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基的取代基取代。

**【0084】** 在還另一個實施方式中，在本發明之具有式 (Ia-A) 的化合物中，

R<sup>1</sup>係C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，

R<sup>2</sup>係氫、氟、氯、或甲基；

R<sup>3</sup>係氫或甲基，

R<sup>4</sup>係氫或甲基；

R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>獨立地選自氫或甲基；

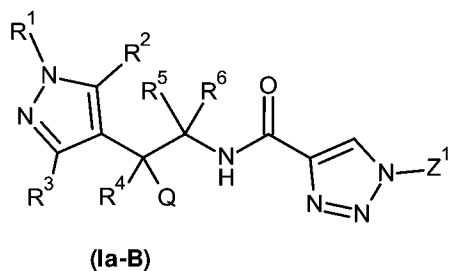
Q係Q1，

R<sup>10</sup>和R<sup>11</sup>獨立地選自氫、鹵素、氰基、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、苯基、5員或6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基中的任一個係未取代的或被1或2個獨立地選自鹵素、氰基或甲基的取代基取代；

R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>獨立地選自氫；並且

Z<sup>1</sup>選自苯基或5員至6員雜芳基；其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N或S的雜原子，並且其中所述苯基和5員至6員雜芳基係未取代的或被1或2個獨立地選自氟、氯、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基的取代基取代。

**【0085】** 在本發明之實施方式中，具有式 (Ia) 的化合物可以是具有式 (Ia-B) 的化合物，其中A係A2：



其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $Q$  ( $Q^1$ 、 $Q^2$ 、 $Q^3$ 、 $Q^4$ 和 $Q^5$ )、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的。

**【0086】** 較佳的是，在本發明之具有式 (Ia-B) 的化合物中，

$R^1$ 係 $C_1$ - $C_4$ -烷基，

$R^2$ 係氫、氟、氯、或甲基；

$R^3$ 係氫或甲基，

$R^4$ 係氫或甲基；

$R^5$ 和 $R^6$ 獨立地選自氫或甲基；並且

$Q$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的。

**【0087】** 在另一個實施方式中，在本發明之具有式 (Ia-B) 的化合物中，

$R^1$ 係 $C_1$ - $C_4$ -烷基，

$R^2$ 係氫、氟、氯、或甲基；

$R^3$ 係氫或甲基，

$R^4$ 係氫或甲基；

$R^5$ 和 $R^6$ 獨立地選自氫或甲基；

$Q$ 係 $Q^1$ 、 $Q^2$ 、或 $Q^3$ ，

$R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、鹵素、氰基、胺基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、苯基、5員或6員雜芳基、或 $C_3$ - $C_6$ 環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和 $C_3$ - $C_6$ -環烷基中的任一個係未取代的或被1或2個獨立地選自鹵素、氰基、或甲基的取代基取代；

$R^{12}$ 和 $R^{13}$ 係氫；並且

$Z^1$ 選自苯基或5員至6員雜芳基；其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N或S的雜原子，並且其中所述苯基和5員至6員雜芳基係未取代的或被1或2個獨立地選自氟、氯、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、或 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基的取代基取代。

【0088】 在還另一個實施方式中，在本發明之具有式 (Ia-B) 的化合物中，

$R^1$ 係 $C_1$ - $C_4$ 烷基，

$R^2$ 係氫、氟、氯、或甲基；

$R^3$ 係氫或甲基，

$R^4$ 係氫或甲基；

$R^5$ 和 $R^6$ 獨立地選自氫或甲基；

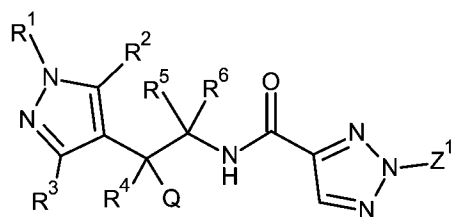
Q係Q1；

$R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、鹵素、氰基、胺基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、苯基、5員或6員雜芳基、或 $C_3$ - $C_6$ 環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和 $C_3$ - $C_6$ -環烷基中的任一個係未取代的或被1或2個獨立地選自鹵素、氰基、或甲基的取代基取代；

$R^{12}$ 和 $R^{13}$ 係氫；並且

$Z^1$ 選自苯基或5員至6員雜芳基；其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N或S的雜原子，並且其中所述苯基和5員至6員雜芳基係未取代的或被1或2個獨立地選自氟、氯、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、或 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基的取代基取代。

【0089】 在本發明之實施方式中，具有式 (Ia) 的化合物可以是具有式 (Ia-C) 的化合物，其中A係A3，並且其中 $R^7$ 係氫：



(Ia-C)



其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $Q$  ( $Q1$ 、 $Q2$ 、 $Q3$ 、 $Q4$ 和 $Q5$ )、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的。

**【0090】** 較佳的是，在本發明之具有式 (Ia-C) 的化合物中，

$R^1$ 係 $C_1$ - $C_4$ -烷基，

$R^2$ 係氫、氟、氯、或甲基；

$R^3$ 係氫或甲基，

$R^4$ 係氫或甲基；

$R^5$ 和 $R^6$ 獨立地選自氫或甲基；並且

$Q$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (II) 的化合物所定義的。

**【0091】** 在另一個實施方式中，在本發明之具有式 (Ia-C) 的化合物中，

$R^1$ 係 $C_1$ - $C_4$ -烷基

$R^2$ 係氫、氟、氯、或甲基；

$R^3$ 係氫或甲基

$R^4$ 係氫或甲基；

$R^5$ 和 $R^6$ 獨立地選自氫或甲基；

$Q$ 係 $Q1$ 、 $Q2$ 或 $Q3$ ；

$R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、鹵素、氰基、胺基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、苯基、5員或6員雜芳基、或 $C_3$ - $C_6$ 環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和 $C_3$ - $C_6$ -環烷基中的任一個係未取代的或被1或2個獨立地選自鹵素、氰基、或甲基的取代基取代；

$R^{12}$ 和 $R^{13}$ 係氫；並且

$Z^1$ 選自苯基或5員至6員雜芳基；其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N或S的雜原子，並且其中所述苯基和5員至6員雜芳基係未取代的或被1或2個獨立地

選自氟、氯、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基的取代基取代。

**【0092】** 在還另一個實施方式中，在本發明之具有式 (Ia-C) 的化合物中，

R<sup>1</sup>係C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，

R<sup>2</sup>係氫、氟、氯、或甲基；

R<sup>3</sup>係氫或甲基，

R<sup>4</sup>係氫或甲基；

R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>獨立地選自氫或甲基；

Q係Q1；

R<sup>10</sup>和R<sup>11</sup>獨立地選自氫、鹵素、氰基、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、苯基、5員或6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基中的任一個係未取代的或被1或2個獨立地選自鹵素、氰基、或甲基的取代基取代；

R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>係氫；並且

Z<sup>1</sup>選自苯基或5員至6員雜芳基；其中所述5員或6員雜芳基包含1個選自N或S的雜原子，並且其中所述苯基和5員至6員雜芳基係未取代的或被1或2個獨立地選自氟、氯、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基的取代基取代。

**【0093】** 在根據本發明之具有式 (I)、(Ia)、(Ia-A)、(Ia-B) 和 (Ia-C) 的化合物的任一種中一個或多個可能的不對稱碳原子的存在意味著該等化合物可以以手性異構物形式存在，即，鏡像異構物或非鏡像異構物的形式。

**【0094】** 較佳的是，根據本發明之具有式 (I) 的化合物選自表C-1至C-21的任一項中列出的化合物或表P中列出的化合物。

**【0095】** 更較佳的是，根據本發明之具有式 (I) 的化合物選自表P中列出的化合物。

**【0096】** 在本發明之一個實施方式中，具有式 (I) 的化合物選自

N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-1-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺，

N-[2-(6-氟基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺，

N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺，

N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-1-(2,4-二氟苯基)-1,2,4-三唑-3-甲醯胺，

N-[2-(6-氟基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲醯胺，

N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲醯胺，

N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-1-(3,5-二氟-2-吡啶基)三唑-4-甲醯胺，

N-[2-(6-溴-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-1-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺，或

N-[2-(6-氟基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-1-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺。

**【0097】** 在本發明之一個實施方式中，具有式 (I) 的化合物選自

N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-1-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺，

N-[2-(6-氟基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺，

N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲

醯胺，

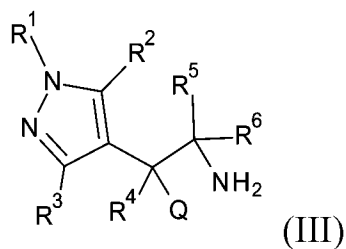
N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-1-(2,4-二氟苯基)-1,2,4-三唑-3-甲醯胺，

N-[2-(6-氟基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲醯胺，或

N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲醯胺。

**【0098】** 以下中間體係新穎的並且本身構成本發明之另一個方面。

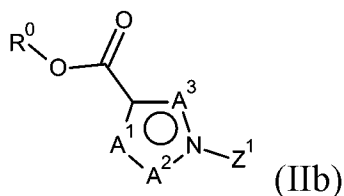
**【0099】** 根據本發明之第五方面，提供了一種具有式 (III) 的中間體化合物或其鹽：



其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 和 $Q$ 對應於與對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物相同的定義。

具有式 (III) 的中間體化合物具有與對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物和它們的對應的較佳的情況的 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 和 $Q$ 的相同的定義。

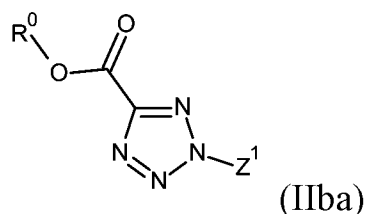
**【0100】** 根據本發明之第六方面，提供了一種具有式 (IIb) 的中間體化合物或其鹽：



其中 $R^0$ 係 $C_1$ - $C_6$ 烷基並且其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的。

具有式 (IIb) 的中間體化合物具有與對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物和它們的對應的較佳的情況的 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $Z^1$ 的相同的定義。

**【0101】** 在一個實施方式中，具有式 (IIb) 的化合物可以是具有式 (IIba) 的化合物，其中 $R^7$ 係氫， $R^0$ 係 $C_1$ - $C_6$ 烷基， $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 係N，並且 $Z^1$ 係如對於根據本發明之具有式 (I) 的化合物所定義的。



**【0102】** 在根據本發明之具有式 (III) 的化合物中一個或多個可能的不對稱碳原子的存在意味著該等化合物可以以手性異構物形式存在，即，鏡像異構物或非鏡像異構物的形式。

#### 【圖式簡單說明】

**【0103】** 無

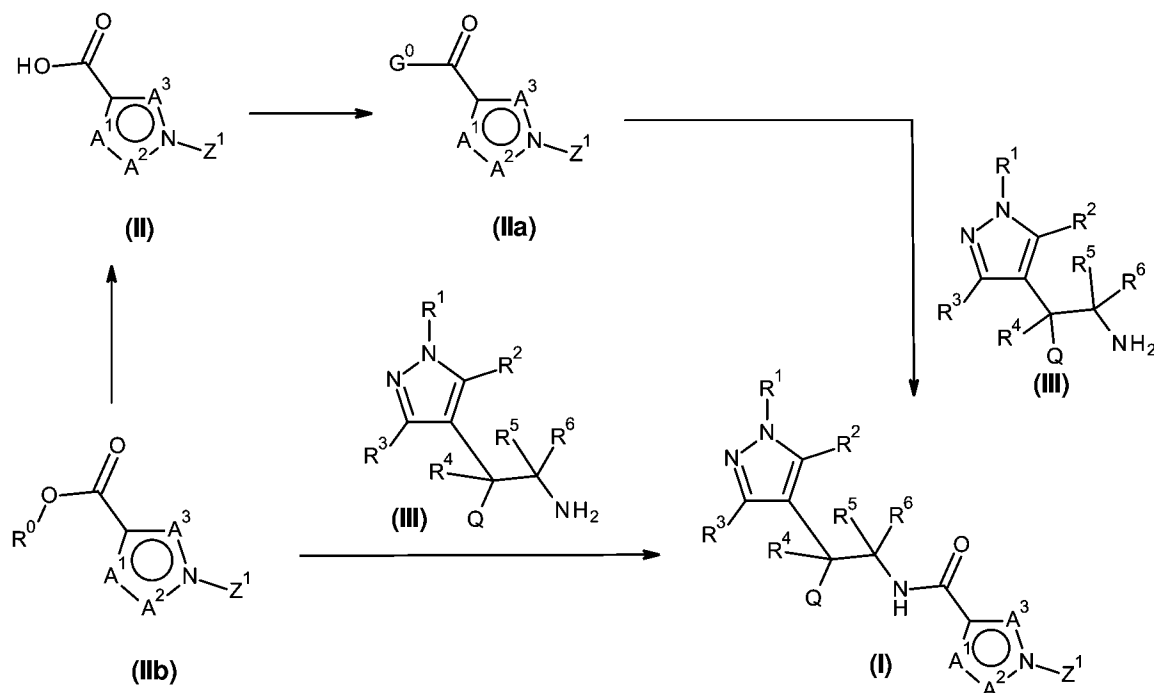
#### 【實施方式】

**【0104】** 如在本發明之任何實施方式中所定義的具有式 (I) 的化合物可以如在以下流程1至15中所示來製備，其中（除非另外說明）每一變數的定義係如上針對根據本發明之任何實施方式中所定義的。

**【0105】** 在以下流程1至15的任一項中，在根據本發明之具有式 (I) 的化合物中一個或多個可能的不對稱碳原子的存在意味著該等化合物能以手性異構物形式存在，即，鏡像異構物或非鏡像異構物的形式。

**【0106】** 更具體地，具有式 (I) 的化合物可以由具有式 (III) 的化合物或其鹽（其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和Q係如以上對於具有

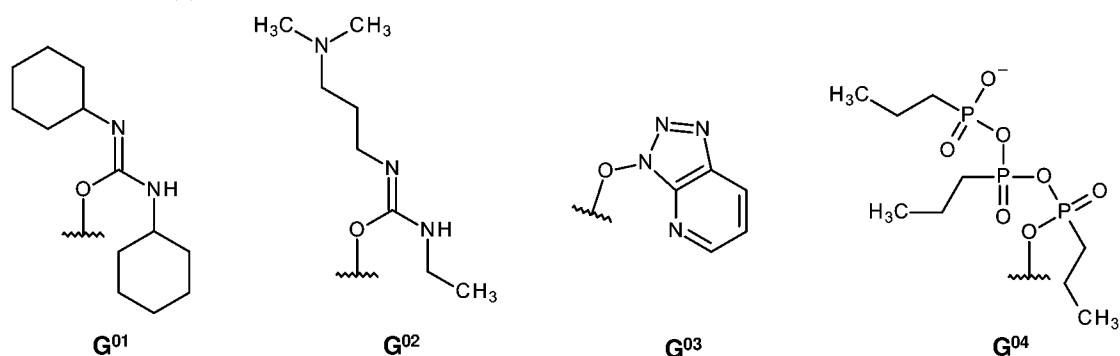
式 (I) 的化合物所定義的) 藉由與具有式 (II) 的化合物 (其中A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>和Z<sup>1</sup>係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的) 的反應製備。此反應示於流程1中。



流程1

**【0107】** 在流程1中，藉由熟悉該項技術者已知的且描述於例如 *Tetrahedron [四面體]* **2005, 61** (46), 10827-10852中之方法，將具有式 (II) 的化合物 (其中A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>和Z<sup>1</sup>係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的) 活化為具有式 (IIa) 的化合物。例如，具有式 (IIa) 的化合物 (其中G<sup>0</sup>係鹵素) 藉由在20°C至100°C之間的溫度下 (較佳的是25°C)，在惰性溶劑如二氯甲烷 (CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>) 或四氫呋喃 (THF) 中，在催化量的N,N-二甲基甲醯胺 (DMF) 的存在下，用例如草醯氯或亞硫醯氯處理具有式 (II) 的化合物形成。用具有式 (III) 的化合物 (其中R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>和Q係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的) 處理具有式 (IIa) 的化合物，視需要在鹼 (例如三乙胺或吡啶) 的存在下，得到具有式 (I) 的化合物。可替代地，具有式 (I) 的化合物可藉由在30°C與180°C之間的溫度下，在惰性溶劑 (例如吡啶、DMF、乙腈、CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>或THF) 中，視需要在鹼 (例如三乙胺) 的存在下，用二環己基碳二亞胺 (DCC)、1-乙基-3-(3-二甲基胺

基丙基)碳二亞胺 (EDC) 或1-[雙(二甲基胺基)亞甲基]-1H-1,2,3-三唑并[4,5-b]吡啶鎊3-氧化六氟磷酸鹽 (HATU) 處理具有式 (II) 的化合物以得到活化的具有式 (IIa) 的化合物 (其中 $G^0$ 係如下所述之 $G^{01}$ 、 $G^{02}$ 或 $G^{03}$  (流程2)) 來製備。最後, 具有式 (II) 的化合物也可藉由與偶合試劑 (如丙膦酸酐 (T3P)) 反應以提供具有式 (IIa) 的化合物 (其中 $G^0$ 係如下所述之 $G^{04}$ ) 來活化, 如例如在*Synthesis [合成]* **2013**, 45, 1569中所述之。進一步與具有式 (III) 的化合物的胺 (或其鹽) 反應得到具有式 (I) 的化合物。



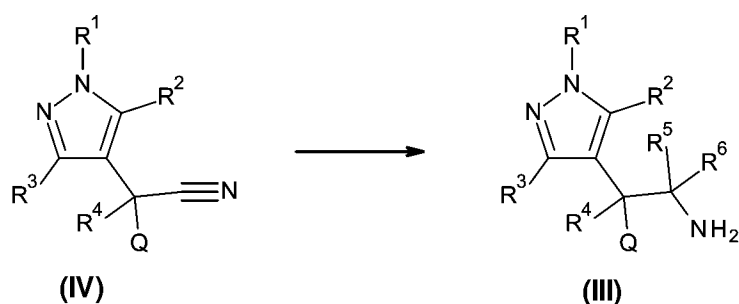
流程2

**【0108】** 具有式 (II) 的化合物可以由具有式 (IIb) 的化合物 (其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 係N並且 $Z^1$ 係如式 (I) 中所述之, 並且 $R^0$ 係 $C_1$ - $C_4$ 烷基) 藉由酯水解來製備。可以使用各種條件, 如例如氫氧化鈉或氫氧化鋰水溶液和有機水混溶性溶劑像 THF 或二甲氧基乙烷或甲醇或乙醇。此類酯水解係熟悉該項技術者熟知的。具有式 (IIb) 的化合物也可以藉由在惰性溶劑 (如甲苯或二氯甲烷) 中在三甲基鋁或三甲基鋁-DABCO 錯合物的存在下使具有式 (IIb) 的化合物與具有式 (III) 的化合物反應而直接轉化為具有式 (I) 的化合物。此類反應已經在文獻中報導 (參見 *Tetrahedron Lett. [四面體通訊]* **1977**, 4171-4174 和 *Tetrahedron Lett. [四面體通訊]* **2006**, 5767-5769, 以及其中引用的參考文獻)。

**【0109】** 具有式 (II) 和 (IIb) 的化合物係可商購的或可以如參見下文所述之來合成。

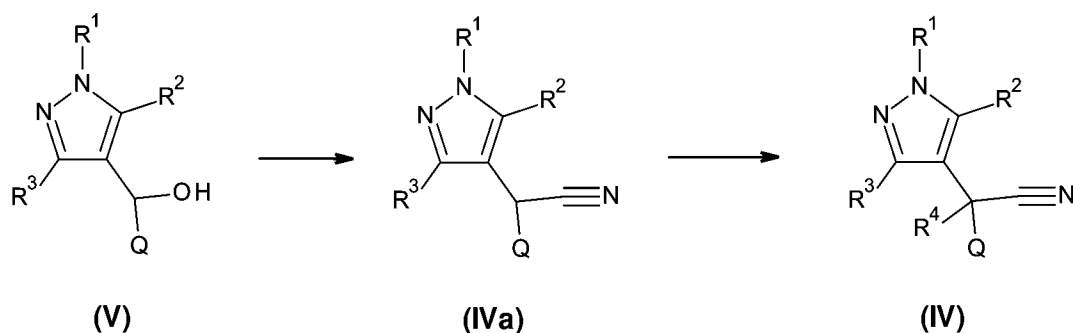
**【0110】** 具有式 (III) 的化合物或其鹽 (其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、

$R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和Q係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的) 可以由熟悉該項技術者藉由在合適的非質子溶劑 (如四氫呋喃) 中具有式 (IV) 的腈 (其中  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和Q係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的) 與合適的親核體 (如(二甲基硫醚)二氫硼 (BMS)) 之間的反應來製備, 例如如*J. Org. Chem. [有機化學雜誌] 1981, 47, 3153*中所述之。可替代地, 格氏 (Grignard) 試劑 $R^5MgBr$ 或 $R^6MgBr$  (其中 $R^5$ 和 $R^6$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的) 可以作為親核體依次地或同時地添加至具有式 (IV) 的化合物中, 以允許製備更高度取代的具有式 (III) 的胺。在路易士酸 (如 $Ti(O^iPr)_4$ ) 的存在下, 在惰性溶劑 (如二乙醚、三級丁基甲基醚和環戊基甲基醚) 中進行此類向腈的格氏加成 (參見*Synlett [合成快報] 2007, (4), 652-654*)。此反應示於流程3中。



流程3

【0111】 具有式 (IV) 的化合物 (其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和Q係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的) 可以由熟悉該項技術者按照已知方法製備。更具體地, 具有式 (IV) 的化合物及其中間體可以由具有式 (V) 的化合物製備, 如流程4中所示出的。



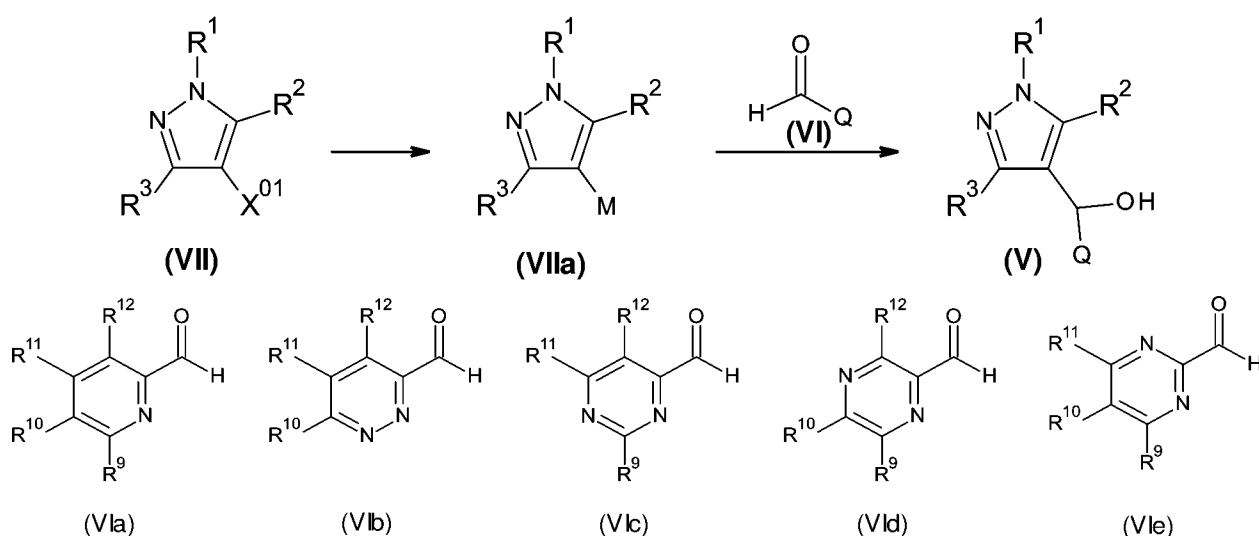
第36頁, 共 143 頁(發明說明書)



## 流程4

【0112】 例如，具有式 (IV) 的化合物（其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和 $Q$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的，並且 $R^4$ 不是氫）可以由熟悉該項技術者藉由在低溫下在惰性溶劑（如四氫呋喃）中使用強鹼（如正丁基鋰或氫化鈉）、隨後添加合適的烷基化試劑 $R^4-X^0$ （其中 $X^0$ 係鹵素）（例如碘甲烷）將具有式 (IVa) 的化合物（其中 $R^4$ 係氫，並且 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 和 $Q$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的）去質子化來製備。具有式 (IVa) 的化合物（其中 $R^4$ 係氫，並且 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 和 $Q$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的）可以由具有式 (V) 的醇藉由在鹼（如碳酸鋰）的存在下在非極性溶劑（如二氯甲烷）中在 $0^\circ\text{C}$ 與反應混合物的沸點之間的溫度下用氰基三甲基矽烷（TMSCN）處理來製備。此類轉化在文獻中在各種條件下是熟知的，例如如在*Org. Lett.* [有機化學通訊] **2008**, *10*, 4570和其中的參考文獻中所述之。此反應示於流程4中。

【0113】 具有式 (V) 的化合物可以由具有式 (VI) 的化合物製備，分別由具有式 (VIa)、(VIb)、(VIc)、(VI d) 或 (VI e) 的化合物中的任一種製備，如流程5中所示出的。

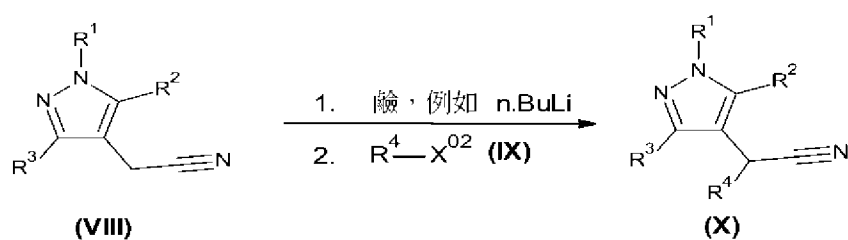


## 流程5

【0114】 如流程5中所示，將具有式 (VII) 的化合物（其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的，並且 $X^{01}$ 係溴或碘）用合適的試劑如turbo格氏試劑（異丙基氯化鎂-氯化鋰錯合物）或烷基鋰（如正丁基鋰）金屬化以得到中間體格氏試劑或烷基鋰試劑（M係 $MgX^{01}$ 或鋰）。此類金屬插入到C- $X^{01}$ 鍵中是熟悉該項技術者熟知的，並且通常在 $-78^\circ C$ 至rt之間的溫度下，在惰性溶劑如醚（例如三級丁基甲基醚或四氫呋喃等）中進行。然後用具有式 (VI) 的化合物，分別用 (VIa)、(VIb)、(VIc)、(VI d) 或 (VIe) 處理金屬化的物質 (VIIa) 的溶液以得到具有式 (V) 的化合物。該等類型的類似反應已經描述在例如WO 2012/102297和*Bio. Med.Chem. Lett.* [生物有機化學與醫藥化學通訊] **2017**, 27(17), 4044-4050 ( $X^{01}$ 係Br、正丁基鋰) 以及*Angew. Chem. Int. Ed.* [應用化學國際版] **2016**, 55(17), 5332-5336、US 2014/0349990、WO 2002/004424、WO 2021/009068 ( $X^{01}$ 係碘、turbo格氏試劑（異丙基氯化鎂-氯化鋰錯合物）) 中。

【0115】 具有式 (VI) 和 (VII) 的化合物係可商購的或容易藉由熟悉該項技術者已知之方法來製備。

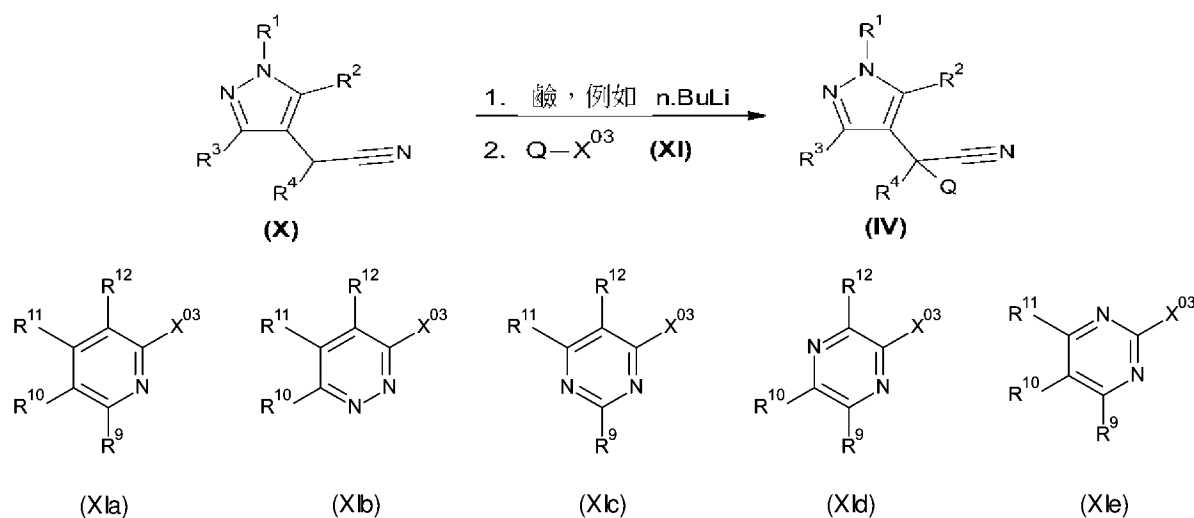
【0116】 具有式 (I) 的化合物的進一步合成包括在惰性溶劑（如四氫呋喃）中，用鹼（如氫化鈉或正丁基鋰）處理具有式 (VIII) 化合物，並且隨後用具有式 (IX) 的化合物（其中 $R^4$ 係如式 (I) 所述之，並且 $X^{02}$ 係脫離基如鹵素、甲磺酸根或甲苯磺酸根）烷基化，以產生具有式 (X) 的化合物。此反應示於流程6中。



流程6

【0117】 然後在惰性溶劑（如四氫呋喃或三級丁基甲基醚）中，在 $-78^\circ C$

至室溫之間的溫度下，用強鹼（如氫化鈉）或烷基鋰鹼（如正丁基鋰）處理具有式 (X) 的化合物（其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 和 $R^4$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的），隨後添加具有式 (XI) 的化合物，分別是具有式 (XIa)、(XIb)、(XIc)、(XIId) 或 (XIIe) 的化合物中的任一種（其中 $R^9$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 和 $R^{12}$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的，並且 $X^{03}$ 係脫離基如鹵素、較佳的是F、Cl或Br）以得到具有式 (IV) 的化合物。此反應示於流程7中。

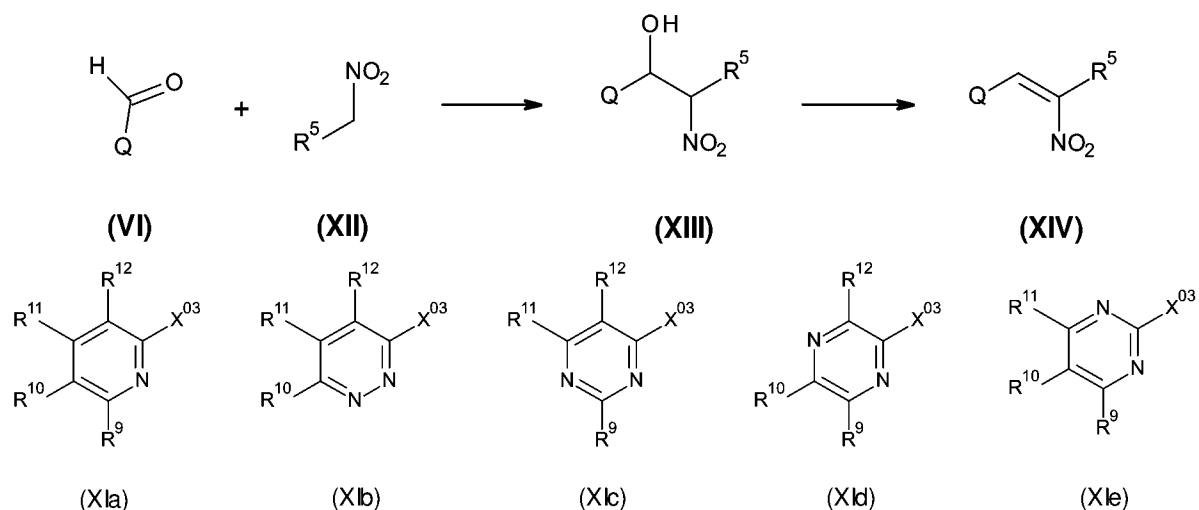


流程7

【0118】 如先前在流程1、2和3中所述之，將具有式 (IV) 的化合物轉化為具有式 (I) 的化合物。熟悉該項技術者將認識到，化合物 (VIII) 轉化為具有式 (IV) 的化合物可以依次地進行或在同一個反應容器中進行，使得具有式 (VIII) 的化合物能夠精簡轉化為具有式 (IV) 的化合物。這在製備實例中進行了更詳細地描述。

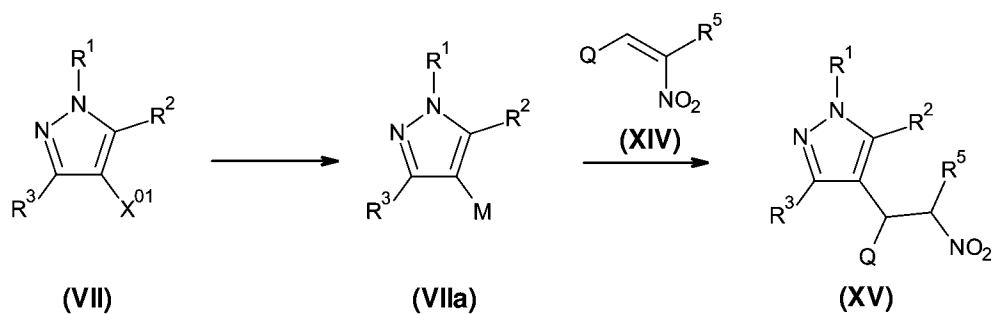
【0119】 具有式 (Ia) 的化合物（其中 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^5$ 、 $Q$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $Z^1$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所述之，並且 $R^4$ 和 $R^6$ 係氫）也可以藉由在鹼（如三乙胺）的存在下，視需要在惰性溶劑（如乙醇或甲醇）中，用具有式 (XII) 的化合物（其中 $R^5$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所述之）處理具有式 (VI) 的化合物，分別是具有式 (VIa)、(VIb)、(VIc)、(VIId) 或

(VIe) 的化合物中的任一種，以得到具有式 (XIII) 的化合物。該等化合物可以藉由在惰性溶劑（如二氯甲烷）中，在鹼（例如三乙胺）的存在下，用酸酐（如三氟乙酸酸酐）處理而分離並轉化為具有式 (XIV) 的化合物。此反應示於流程8中。



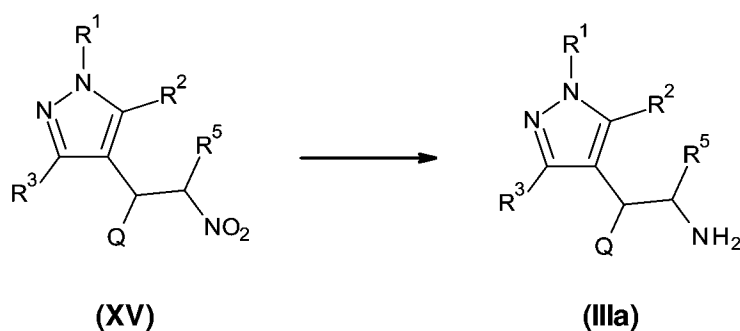
流程8

【0120】 熟悉該項技術者將理解，具有式 (VI) 的化合物可以轉化為具有式 (XIV) 的化合物，而無需分離具有式 (XIII) 的中間體。此類反應（稱為亨利反應）在文獻中有很好的描述，如在 *Tetrahedron. [四面體]* **2001**, 57(6), 915-945 和其中引用的參考文獻中所證明的。具有式 (XIV) 的化合物可以藉由在惰性溶劑（如四氫呋喃）中用具有式 (VIIa) 的化合物處理（參見流程5）轉化為具有式 (XV) 的化合物，熟悉該項技術者已知為有機金屬化合物與硝基烯烴的邁克爾反應。此反應示於流程9中。



流程9

【0121】 有機金屬化合物與硝基烯烴的類似邁克爾加成已報導於例如 *Org. Lett.* [有機化學通訊] 2007, 9, 85-87中。將具有式 (XV) 的化合物中的硝基還原成胺以得到具有式 (IIIa) 的化合物 (其中R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>和Q係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的，並且R<sup>4</sup>和R<sup>6</sup>係氫)可以藉由熟悉該項技術者通常已知的多種方法實現，如貝尚還原，或在金屬催化劑的存在下用氫還原。此反應示於流程10中。

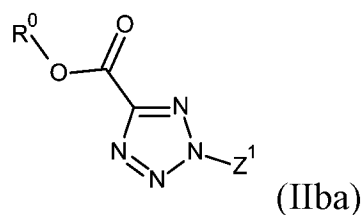


流程10

【0122】 藉由在流程1和2中所述之方法將具有式 (IIIa) 的化合物轉化為具有式 (Ia) 的化合物。

【0123】 具有式II的化合物係可商購的或可以如參見下文所述之來合成。

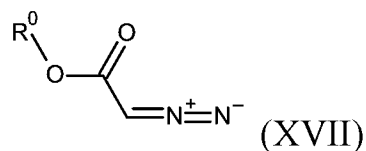
【0124】 具有式 (IIb) 的化合物，其中A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>係N並且Z<sup>1</sup>係如式 (I) 中所述之，即具有式 (IIba) 的化合物



可以藉由使以下反應來獲得：具有式 (XVI) 的重氮鹽

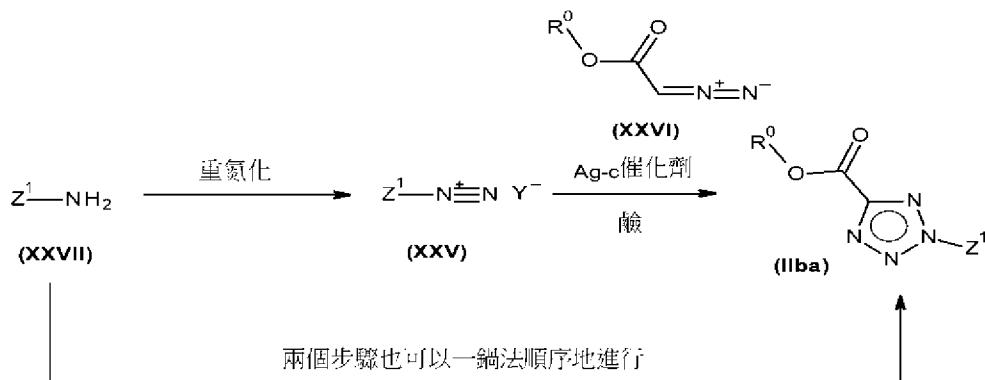


其中Z<sup>1</sup>係如以上在式I中所定義的並且Y<sup>-</sup>係相對離子，取決於其中進行重氮化步驟的條件，例如Cl<sup>-</sup>或BF<sub>4</sub><sup>-</sup>，和具有式 (XVII) 的化合物，



其中 $R^0$ 係 $C_1$ - $C_6$ 烷基。此反應可以用各種銀鹽催化，較佳的銀鹽係乙酸銀，並在各種溶劑（例如THF、DMF或甲苯或其混合物）中，通常在 $0^\circ\text{C}$ 與 $25^\circ\text{C}$ 之間的溫度下，在至少一當量的鹼（例如碳酸鈉）的存在下進行。該等偶極[3+2]環加成係高度位置選擇性的並且描述於例如*Tetrahedron [四面體]* **2020**, 76(14), 131063中。如就在之前定義的具有式 (XVI) 的化合物可以由具有式 (XVIII) 的伯胺藉由與重氮化試劑（例如亞硝酸的鹽，例如亞硝酸鈉）反應來製備。溶劑可以是酸的水溶液，例如稀鹽酸或四氟硼酸。相對離子 $Y^-$ 由所用的酸來定義。重氮化反應通常用於有機合成，甚至在工業規模上，並且是熟悉該項技術者已知的。

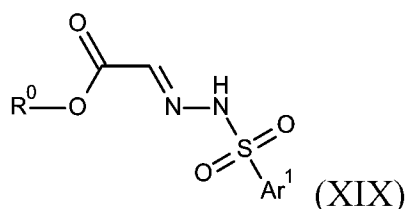
**【0125】** 為了降低具有式 (XVI) 的中間體分解的風險，重氮化步驟和環加成步驟可以順序進行，而不需要分離 (XVI)。此變體也描述於*Tetrahedron [四面體]* **2020**, 76(14), 131063中。該化學過程概括於流程11中：



流程11

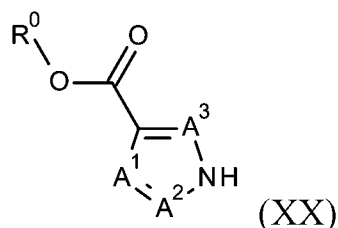
**【0126】** 具有式 (XVII) 的化合物係可商購的，和具有式 (XVII) 的化合物（例如， $R^0$ 係甲基，CAS [6832-16-2]）一樣。

**【0127】** 非常類似地，具有式 (IIba) 的化合物（其中 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 係N並且 $Z^1$ 係如式 (I) 中所述之）可以藉由使具有式 (XIX) 的化合物：

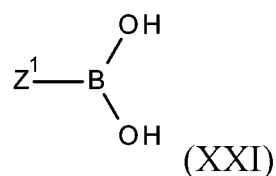


其中R<sup>0</sup>係C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基並且Ar<sup>1</sup>係苯基或對甲苯基，與具有式 (XVI) 的化合物在鹼（例如吡啶）的存在下在從-50°C至50°C的溫度下反應以產生具有式 (IIba) 的化合物來製備。此類反應在文獻中有好的先例，例如*Chem. Comm. [化學通訊]* **2017**, 53(69), 9620-9623，*Angew. Chem. Int. Ed. [應用化學國際版]* **2017**, 56(47), 15044-15048和*J. Am. Chem. Soc. [美國化學會誌]* **2016**, 138(44), 14609-14615。具有式 (XXVIII) 的化合物如參見上文引用的文獻中所述之製備並在本申請的製備實例中舉例說明。

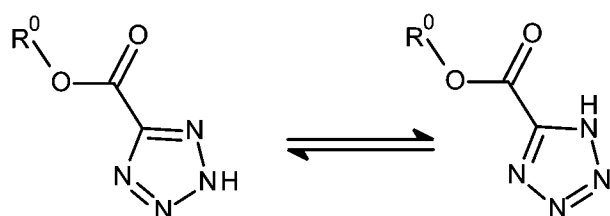
**【0128】** 可替代地，具有式 (IIba) 的化合物，其中A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>和A<sup>3</sup>係N並且Z<sup>1</sup>係如式 (I) 中所定義的，可以藉由以下來獲得：偶合具有式 (XX) 的化合物，



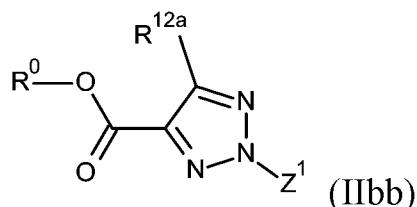
其中A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>和A<sup>3</sup>係N，並且R<sup>0</sup>係如參見上文所述之，與具有式 (XXI) 的硼酸衍生物，



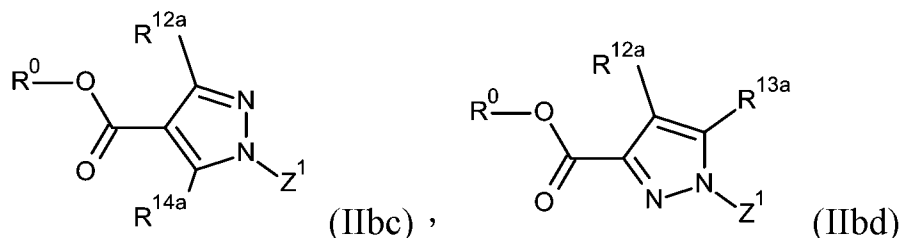
其中Z<sup>1</sup>係如式I中所定義的。此Chan-Lam型偶合反應通常在溶劑（像二氯甲烷）中，在催化量的銅基催化劑的存在下，在溫和的反應溫度下，在鹼（如碳酸鉀）的存在下，在大氣或氧氣下進行。應當注意，具有式 (XX) 的化合物（其中A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>和A<sup>3</sup>係N）以互變異構形式存在。



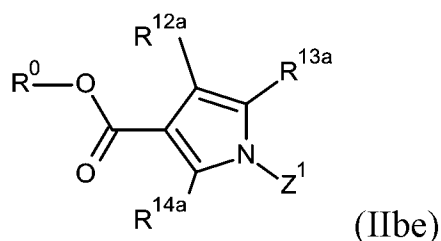
熟悉該項技術者將設想，此反應的偶合產物可以是位置異構物之一或其混合物，但當反應條件如*J. Org. Chem. [有機化學雜誌]* **2014**, 79, 6703-6707中所述之選擇時，該反應對具有式 (IIba) 的化合物顯示出優異的位置選擇性。熟悉該項技術者將認識到，此Chan-Lam偶合係用於製備具有式 (IIb) 的化合物的通用方法。實例已在文獻中示出，對於具有式 (IIbb) 的化合物



其中Z<sup>1</sup>、R<sup>12a</sup>和R<sup>0</sup>係如先前所定義的（參見*J. Med. Chem. [藥物化學雜誌]* **2018**, 61, 8, 3370-3388和WO 14/041106），具有式 (IIbc) 和 (IIbd) 的化合物



其中Z<sup>1</sup>、R<sup>12a</sup>、R<sup>13a</sup>、R<sup>14a</sup>和R<sup>0</sup>係如式 (I) 中所定義的（參見WO 15/155626，EP 2390252）和具有式 (IIbe) 的化合物

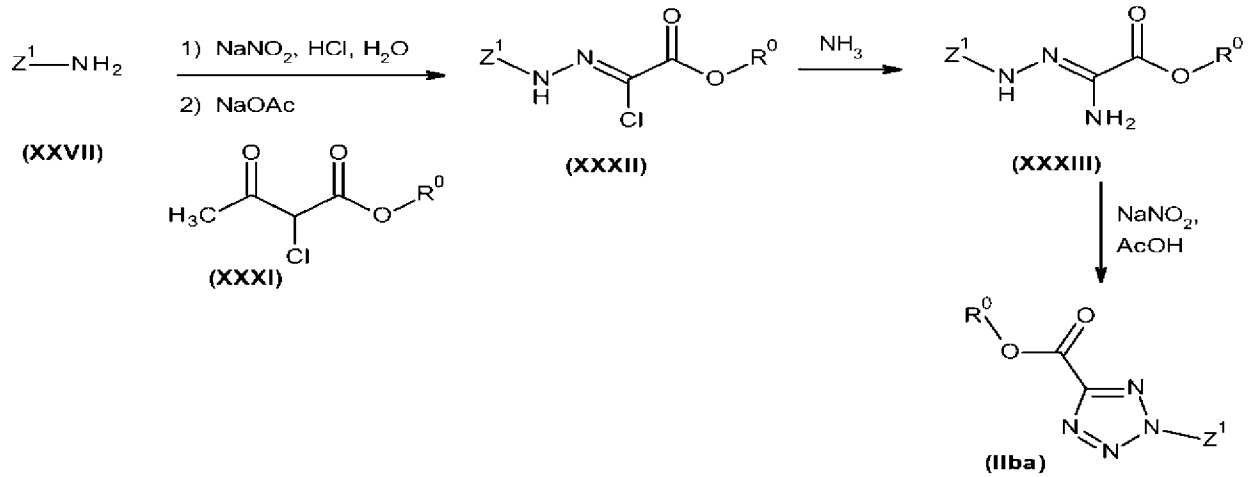


其中Z<sup>1</sup>、R<sup>12a</sup>、R<sup>13a</sup>、R<sup>14a</sup>和R<sup>0</sup>係如式 (I) 中所定義的（參見*J. Med. Chem. [藥物化學雜誌]* **2017**, 60(14), 6166-6190, *Org. Lett. [有機化學通訊]* **2008**, 10(8), 1653-1655和*Bio. Med. Chem. Lett. [生物有機化學與醫藥化學通訊]* **2009**, 19(5), 1451-



1456)，作為代表性實例。

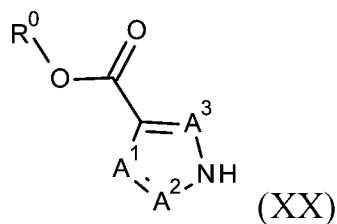
【0129】 用於製備具有式 (IIba) 的化合物 (其中A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>和A<sup>3</sup>係N並且Z<sup>1</sup>係如式 (I) 中所定義的) 的另一種方法如流程12中所示。



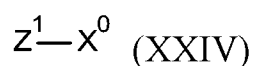
流程12

【0130】 如流程12中所示，順序開始於如參見上文先前所述之具有式 (XVIII) 的化合物的重氮化並且然後在溫和鹼 (例如乙酸钠) 的存在下用具有式 (XXII) 的化合物 (其中R<sup>0</sup>係C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基) 處理重氮鹽以產生具有式 (XXIII) 的化合物。具有式 (XXIII) 的化合物 (其中Z<sup>1</sup>和R<sup>0</sup>係如先前所定義的) 然後在0°C至30°C之間的溫度下在可混溶的有機溶劑 (例如四氫呋喃或2-甲基四氫呋喃) 中用胺水處理，以得到具有式 (XXIV) 的化合物。最後，在-20°C至0°C之間的溫度下在微酸性介質 (例如乙酸或鹽酸水溶液) 中將具有式 (XXIV) 的化合物用亞硝酸的鹽 (例如亞硝酸鈉) 重氮化導致所形成的重氮鹽自發環化為具有式 (IIba) 的四唑化合物。反應的順序先前已經在WO 13/087805中進行了描述。

【0131】 具有式 (IIb) 的化合物也可以藉由以下來製備：將具有式 (XX) 的化合物

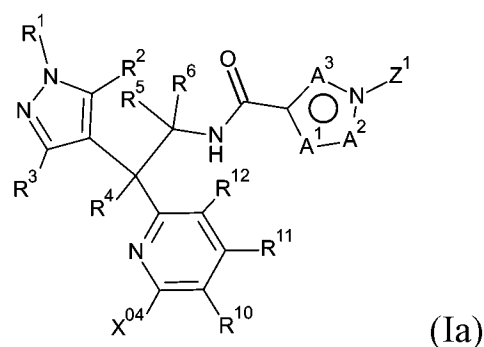


用具有式 (XXIV) 的化合物烷基化



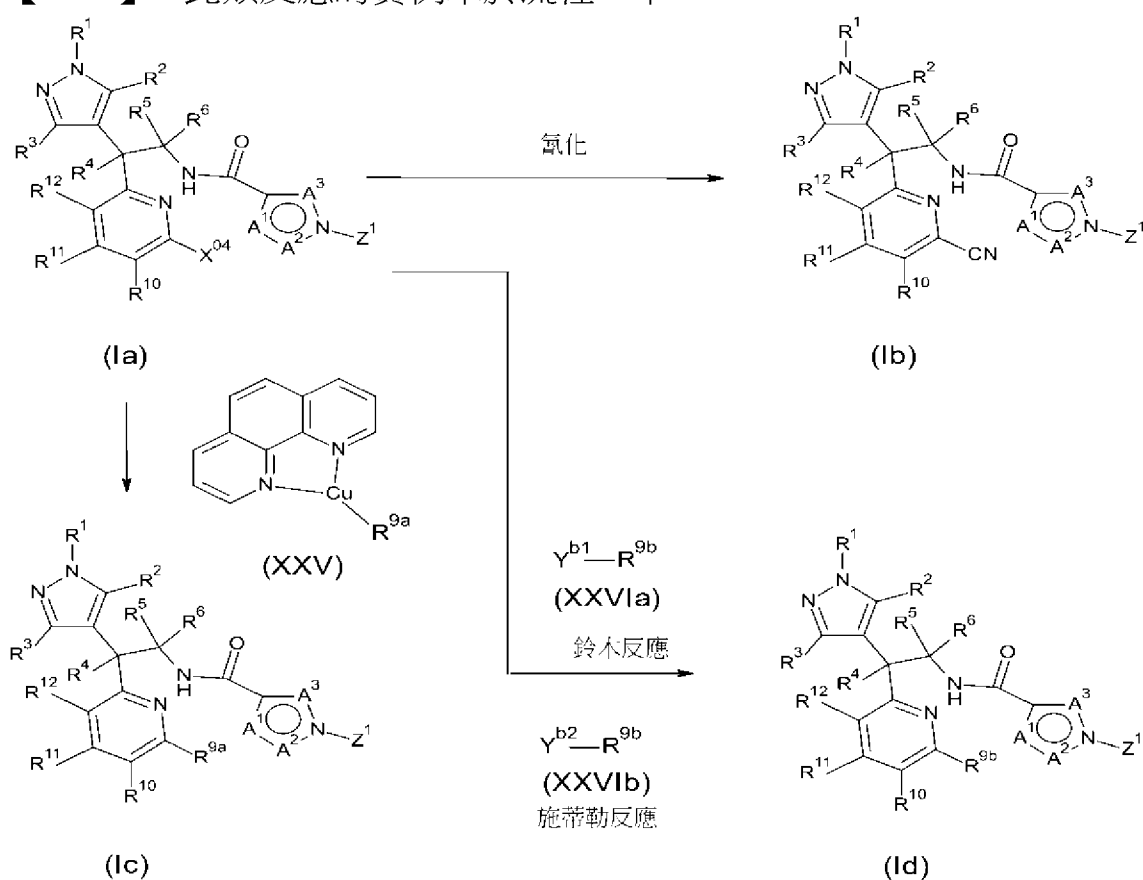
其中 $Z^1$ 係如先前在式I下所述之並且 $X^0$ 係鹵素，較佳的是氯、溴或碘，在鹼（例如）和鹼土金屬鹼（如NaOH、KOH、LiOH、 $Cs_2CO_3$ 、 $K_2CO_3$ 等）的存在下，在惰性非質子或質子溶劑中。此種烷基化係熟悉該項技術者熟知的並且在此背景下已經用於製備具有式 (IIb) 的化合物，如例如在WO 14/168221；WO 10/043000；以及WO 14/32498中所述之。熟悉該項技術者將認識到，這可以產生可以藉由層析技術分離的位置異構化合物的混合物，或者純異構物可以藉由明智地選擇條件和添加劑（例如用於所謂的Buchwald胺化的鈀催化劑）來獲得。對於其中 $Z^1$ 係雜芳基或芳基的情況， $SnAr$ 反應（具有或不具有銅催化）可用於製備具有式 (IIb) 的化合物（參見例如，*Polyhedron [多面體]* **2019**, 165, 22-30；US 2018/0170909；*Org. Lett. [有機化學通訊]* **2022**, 24(20), 3620-3625，*J.Org. Chem. [有機化學雜誌]* **2017**, 82(14), 7420-7427，*Chem. Comm. [化學通訊]* **2021**, 57(57), 7047-7050，*ACS Catalysis [ACS催化]* **2019**, 9(12), 10674-10679，*Synthesis [合成]* **2017**, 49(23), 5120-5130，*J.Org. Chem. [有機化學雜誌]* **2019**, 84(12), 8160-8167，以及其中引用的參考文獻）。

**【0132】** 根據本發明之另外的化合物可以藉由在合成的後續階段使用關鍵的中心中間體進行衍生來製備。例如，具有式 (I) 的化合物，其中Q係 $Q^1$ ，並且 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $Z^1$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的，並且 $X^{04}$ 係鹵素、較佳的是溴或氯，例如，具有式 (Ia) 的化合物：



允許進行進一步的化學反應，如鈀催化的羰基化，鈴木反應，施蒂勒偶合，銅催化的磺醯基、鹵代烷基和氰基部分的引入，以及與各種親核體的 $\text{SnAr}$ 反應。

【0133】 此類反應的實例示於流程13中。



流程13

【0134】 如流程13中所示，具有式 (I) 的化合物（其中Q係Q1，並且 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $Z^1$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的，並且 $R^9$ 係氰基，即具有式 (Ib) 的化合物）可以由具有式 (Ia) 的化合物藉由在惰性溶劑（如二甲基甲醯胺（DMF）或N-甲基-2-吡咯啉酮）中，

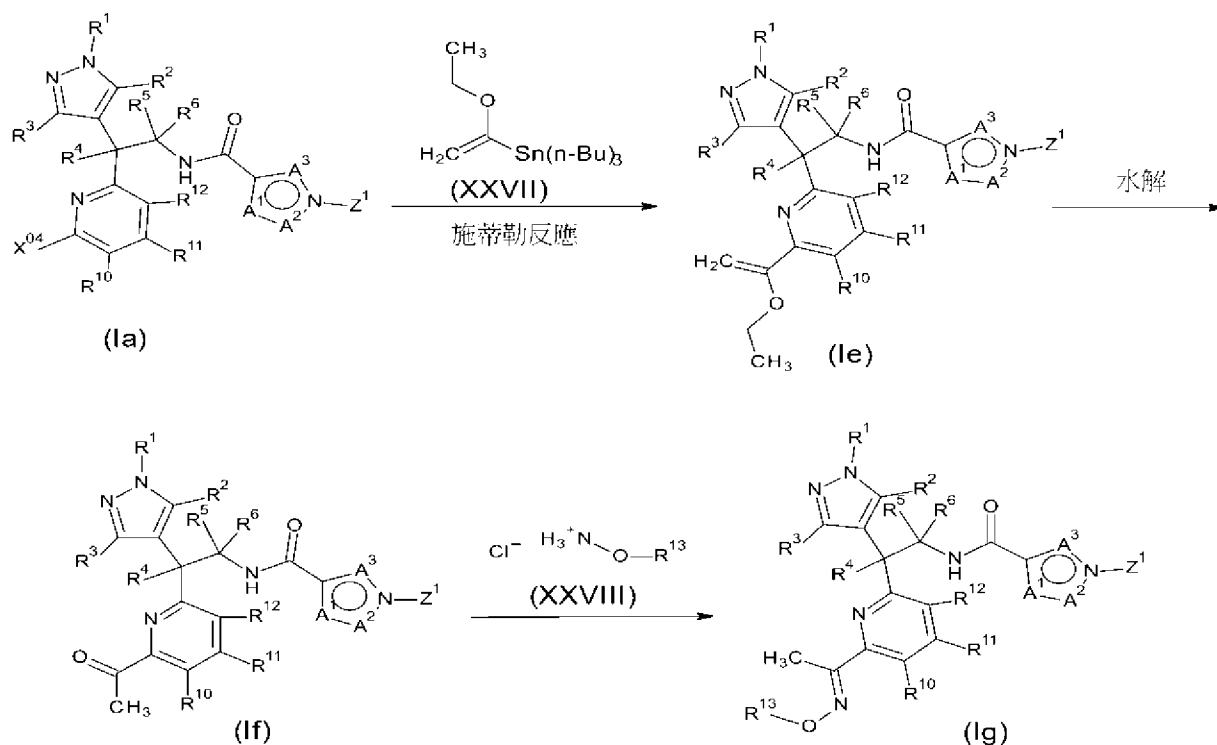
在0°C與150°C之間的溫度下用無機氰化物源（如CuCN）處理來獲得。此類反應在文獻中是熟知的，例如，在*J. Het. Chem. [雜環化學雜誌]* **1987**, 24(2), 373-6，*Liebigs Ann. Chem. [李比希化學年鑒]* **1994**, (10), 1049-53，以及*Org. Prep. Proc. Int. [國際有機物製備與程序]* **1985**, 17(6), 391-9中。藉由取代鹵素原子引入氰基的其他方法係本領域已知的。參見，例如，*Science of Synthesis [合成科學]* **2004**, 19, 173-195。

**【0135】** 具有式 (I) 的化合物（其中Q係Q1，並且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>和Z<sup>1</sup>係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的，並且R<sup>9a</sup>係C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基，即具有式 (Ic) 的化合物）可以藉由在惰性溶劑（如DMF或N-甲基-2-吡咯啉酮）中，在室溫與150°C之間的溫度下用具有式 (XXV) 的化合物（其中R<sup>9a</sup>係C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基）處理具有式 (Ia) 的化合物（其中Q係Q1，並且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>和Z<sup>1</sup>係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的，並且X<sup>04</sup>係鹵素、較佳的是溴）來製備。此類反應在文獻中是已知的（*Org. Lett. [有機化學通訊]* **2014**, 16(6), 1744-1747）。具有式 (I) 的化合物（其中Q係Q1，並且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>和Z<sup>1</sup>係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的，並且R<sup>9b</sup>係苯基、5員或6員雜芳基或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1、2、3或4個單獨地選自N、O或S的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基中的任一個係未取代的或被1、2或3個獨立地選自鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基和C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基的取代基取代，即具有式 (Id) 的化合物）可以藉由鈴木反應製備（如流程13中所示），該反應包括例如使具有式 (Ia) 的化合物（其中X<sup>04</sup>係脫離基，像例如氫、溴或碘）與具有式 (XXVIa) 的化合物（其中Y<sub>b1</sub>可以是硼衍生的官能基，如例如B(OH)<sub>2</sub>或B(OR<sub>b1</sub>)<sub>2</sub>，其中R<sub>b1</sub>可以是C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或者兩個基團OR<sub>b1</sub>可以與硼原子一起形成五員環，如例如醌硼酸酯）反應。該反應藉由基於鈹

的催化劑(例如四(三苯基膦)-鈀或(1,1'-雙(二苯基膦基)-二茂鐵)二氧化鈀-二氯甲烷(1:1錯合物)),在鹼(像碳酸鈉或氟化鈾)的存在下,在溶劑或溶劑混合物(像例如1,2-二甲氧基乙烷和水、或二噁烷(dioxane)和水、或甲基四氫呋喃和水的混合物)中,較佳的是在惰性氣氛下進行催化。反應溫度的範圍可以較佳的是從室溫至反應混合物的沸點。此類鈴木反應係熟悉該項技術者熟知的,並且已經綜述於例如*J. Organomet. Chem.* [有機金屬化學雜誌] **1999**, 576, 147-168中。

**【0136】** 可替代地,具有式 (Ic) 的化合物可以藉由具有式 (XXVIb) 的化合物(其中 $Y_{b2}$ 係三烷基錫衍生物,較佳的是三正丁基錫)與具有式 (Ia) 的化合物的施蒂勒反應來製備。此類施蒂勒反應在鈀催化劑(例如四(三苯基膦)鈀(0)或(1,1'-雙(二苯基膦基)-二茂鐵)二氧化鈀-二氯甲烷(1:1錯合物))的存在下,在惰性溶劑(如DMF、乙腈、或二噁烷)中,視需要在添加劑(如氟化鈾、或氯化鋰)的存在下,並且視需要在另外的催化劑(例如碘化銅(I))的存在下進行。此類施蒂勒偶合也是熟悉該項技術者熟知的,並且已經描述於例如*J. Org. Chem.* [有機化學雜誌] **2005**, 70, 8601-8604, *J. Org. Chem.* [有機化學雜誌] **2009**, 74, 5599-5602, 和*Angew. Chem. Int. Ed.* [應用化學國際版], **2004**, 43, 1132-1136中。大量的具有式 (XXVIa) 和 (XXVIb) 的化合物係可商購的或可以由熟悉該項技術者製備。

**【0137】** 由具有式 (Ia) 的化合物可獲得的另外的化合物示於流程14中。

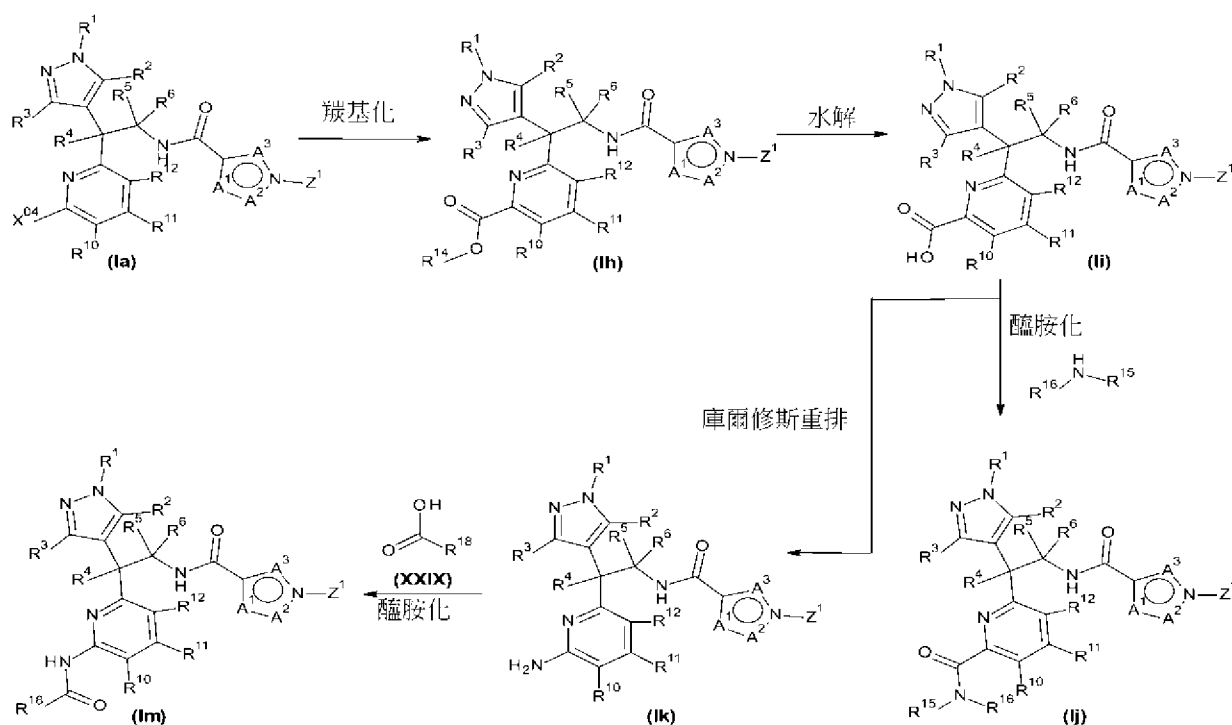


流程14

【0138】 如流程14中所示，具有式 (I) 的化合物（其中Q係Q1，並且 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $Z^1$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的，並且 $X^{04}$ 係脫離基像例如氯、溴或碘，即具有式 (Ia) 的化合物）可以在施蒂勒反應條件下用具有式 (XXVII) 的化合物處理以得到具有式 (Ie) 的化合物。具有式 (Ie) 的化合物可以被分離，或在含水酸性條件下直接水解以得到具有式 (If) 的化合物。此類反應在文獻中是已知的，並且已經描述於例如*Synthesis [合成]* **2001**, (10), 1551-1555和*Tetrahedron [四面體]* **2001**, 57(13), 2507-2514中。藉由在惰性溶劑（如甲醇、乙醇、四氫呋喃、甲基）中，視需要在無機鹼（如碳酸鈉或碳酸鉀）或有機鹼（如三乙胺等）的存在下用具有式 (XXVIII) 的化合物（或其鹽）（其中 $R^{13}$ 係氫或 $C_1$ - $C_4$ 烷基）處理具有式 (If) 的化合物，可以將具有式 (If) 的化合物轉化為具有式 (Ig) 的化合物（其中Q係Q1，並且 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $Z^1$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的，並且 $R^{13}$ 係氫或 $C_1$ - $C_4$ 烷基）。用於製備此類肟的許

多實例在文獻中是已知的（參見，例如，*Molecules [分子]* **2019**, 24, 2470和其中引用的參考文獻），並且是熟悉該項技術者熟知的。

【0139】 可以由具有式 (I) 的化合物（其中Q係Q1，並且 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $Z^1$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的，並且 $X^{04}$ 係脫離基像例如氯、溴或碘，即具有式 (Ia) 的化合物）製備的另外的化合物示於流程15中。



【0140】 如流程15中所示，具有式 (Ia) 的化合物可以羰基化以得到具有式 (I) 的化合物，即具有 $R^{14}$   $C_1$ - $C_4$ 烷基的具有式 (Ih) 的化合物，其中Q係Q1，並且 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $Z^1$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的，在此類烷氧基羰基化中，使具有式 (Ia) 的化合物與一氧化碳反應，通常在壓力下，在金屬催化劑如鈀催化劑（例如，乙酸鈀(II)、[1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵]二氯化鈀(II) ( $Pd(dppf)Cl_2$ )、雙(三苯基膦)二氯化鈀(II) ( $PdCl_2(PPh_3)_2$ ) 或雙(二苯基膦基)丙烷鈀(II) ( $PdCl_2(dipp)$ ) 的存在下，視需要在膦配位基（如三苯基膦或1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵）的存在下，在醇

( $R^{14}OH$ ) (典型地甲醇或乙醇) 的存在下 (其中 $R^{14}$ 係 $C_1$ - $C_4$ 烷基), 視需要在共溶劑 (例如甲苯、二噁烷或 $N,N$ -二甲基甲醯胺) 的存在下, 並且較佳的是在鹼 (例如像三甲胺) 的存在下, 在 $20^\circ C$ 與 $200^\circ C$ 之間、較佳的是在 $50^\circ C$ 與 $180^\circ C$ 之間的溫度下。此類羰基化反應對於熟悉該項技術者以及還有在文獻中皆為熟知的 (參見 *J. Org. Chem.* [有機化學雜誌] **2008**, 73, 7102-7107, 以及其中引用的參考文獻)。此類具有式 (Ih) 的化合物可以在熟悉該項技術者已知的條件 (例如像在室溫下或直到回流條件下, 在甲醇、乙醇、四氫呋喃或二噁烷中的氫氧化鈉、氫氧化鉀或氫氧化鋰水溶液的條件) 下容易地皂化成具有式 (Ii) 的化合物。可替代地, 在溶劑 (如 $N,N$ -二甲基甲醯胺、 $N,N$ -二甲基乙醯胺或 $N$ -甲基-2-吡咯啉酮) 中用鹵化物陰離子 (較佳的是氯離子, 例如源自氯化鋰 (或可替代地氯化鈉或氯化鉀)) 處理具有式 (Ih) 的酯化合物也可以產生具有式 (Ii) 的羧酸化合物。此種 $O$ -脫甲基化的反應溫度範圍較佳的是從 $20^\circ C$ 至反應混合物的沸點, 或者該反應可以在微波輻射下進行。具有式 (Ii) 的化合物可以轉化為具有式 (I) 的醯胺, 即具有式 (Ij) 的化合物, 其中 $R^{15}$ 和 $R^{16}$ 獨立地是氫或 $C_1$ - $C_4$ 烷基, 其中 $Q$ 係 $Q^1$ , 並且 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $Z^1$ 係如對於具有式 (I) 的化合物所定義的。此類反應通常包括活化羧基, 隨後用化合物 $R^{15}R^{16}NH$ 處理或使用偶合劑在用具有式 $R^{15}R^{16}NH$ 的化合物處理後進行將酸直接轉化為醯胺。該等方法已經參見上文在流程1和2中進行了討論。

**【0141】** 進一步地, 具有式 (Ij) 的化合物可以藉由所謂的庫爾修斯重排轉化為具有式 (I) 的化合物, 即具有 $R^9$ 胺基的具有式 (Ik) 的化合物, 其中 $Q$ 係 $Q^1$ , 並且 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^{10}$ 、 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $A^1$ 、 $A^2$ 、 $A^3$ 和 $Z^1$ 係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的。在庫爾修斯重排中, 在合適的鹼的存在下、並且視需要在路易士酸存在或不存在下, 在惰性溶劑中, 在 $50^\circ C$ 與 $200^\circ C$ 之間的溫度下, 用有機疊氮化物處理具有式 (Ij) 的化合物。有機疊氮化物的實例包括



TMSN<sub>3</sub>、疊氮化鈉、二苯基磷醯基疊氮化物或甲苯磺醯基疊氮化物，並且合適的溶劑可以是甲苯、二甲苯、THF或乙腈。合適的路易士酸的實例可以包括尤其Zn(OTf)<sub>2</sub>。重排中形成的異氰酸酯與水反應形成胺基甲酸酯，該胺基甲酸酯在反應條件下脫羧成相應的具有式 (Ik) 的胺。可替代地，該等反應可以在醇（例如三級丁醇）中進行，從而允許分離出胺基甲酸三級丁酯。該等進而可以在單獨的步驟中藉由熟悉該項技術者已知之方法用酸（如三氟乙酸）裂解以產生具有式 (Ik) 的化合物。此類庫爾修斯反應的實例已經報導於例如*Org. Lett. [有機化學通訊]* **2005**, 7, 4107-4110, *J. Med.Chem. [藥物化學雜誌]* **2006**, 49(12), 3614-3627和*Tetrahedron [四面體]* **1974**, 30, 2151-2157中。根據參見上文所述之醯胺化方法，藉由用具有式 (XIX) 的化合物處理可以將如此獲得的具有式 (Ik) 的化合物醯胺化為具有式 (Im) 的化合物（其中Q係Q1，並且R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>和Z<sup>1</sup>係如以上對於具有式 (I) 的化合物所定義的，並且R<sup>18</sup>係C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基）。熟悉該項技術者將認識到，這種化學反應可以應用於任何具有式 (I) 的化合物，其中Q係Q1、Q2、Q3、Q4、或Q5，位於具有式Q的雜環的任何位置（即R<sup>9</sup>、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>或R<sup>12</sup>）上，當後面的基團係脫離基如鹵素原子時。

**【0142】** 藉由以常規方式將起始化合物的一個或多個取代基用根據本發明之另一個或其他的取代基替代可以將如在本發明之任何實施方式中所定義的具有式 (I) 的化合物按本身已知的方式轉化為如在本發明之任何實施方式中所定義的另一種化合物。熟悉該項技術者還將理解，具有式 (I) 的化合物可以藉由例如烷基化、親核取代、消除、在金屬催化劑的存在下的C-C鍵形成反應、在金屬催化劑的存在下的雜原子-碳鍵形成、氧化和還原進一步轉化為具有式 (I) 的另外的衍生物。

**【0143】** 取決於所選的適合各自情況的反應條件以及起始材料，有可能例如，在一個反應步驟中僅將一個取代基用根據本發明之另一個取代基替代，或者

在同一個反應步驟中可以將多個取代基用根據本發明之其他取代基來替代。

**【0144】** 具有式 (I) 的化合物的鹽可以以本身已知的方式製備。因此，例如，具有式 (I) 的化合物的酸加成鹽係藉由用合適的酸或合適的離子交換試劑進行處理來獲得的，並且與鹼的鹽係藉由用合適的鹼或用合適的離子交換試劑進行處理來獲得的。

**【0145】** 具有式 (I) 的化合物的鹽能夠以常規方式轉化為游離的化合物 (I)、酸加成鹽（例如藉由用合適的鹼性化合物或用合適的離子交換試劑進行處理）以及與鹼的鹽（例如藉由用合適的酸或用合適的離子交換試劑進行處理）。

**【0146】** 具有式 (I) 的化合物的鹽能夠以本身已知的方式轉化為具有式 (I) 的化合物的其他鹽、酸加成鹽，例如轉化成其他酸加成鹽，例如藉由在合適的溶劑中用酸的合適的金屬鹽（如鈉、鋇或銀的鹽，例如用乙酸銀）來處理無機酸的鹽（如鹽酸鹽），在該溶劑中，所形成的無機鹽（例如氯化銀）係不溶的並且因此從反應混合物中沈澱出。

**【0147】** 取決於程序或反應條件，具有成鹽特性的具有式 (I) 的化合物能夠以游離形式或以鹽的形式獲得。

**【0148】** 具有式 (I) 的化合物和適當時其互變異構物（在每種情況下以游離形式或以鹽形式）能夠以可能的異構物之一的形式或以該等異構物的混合物的形式，例如以純異構物（如對映體和/或非鏡像異構物）形式或以異構物混合物（如鏡像異構物混合物，例如外消旋物；非鏡像異構物混合物或外消旋物混合物）形式存在，取決於分子中存在的不對稱碳原子的數目、絕對和相對組態和/或取決於分子中存在的非芳香族雙鍵的組態；本發明關於純異構物以及還有可能的所有異構物混合物，並且在上下文的每種情況下，甚至在沒有具體提及立體化學細節的每種情況下，都應該從這層意義上來理解。

**【0149】** 本發明之具有式 (I) 的化合物在雙苄基位置處展現出不對稱碳

原子：

**【0150】** 技術人員將會充分理解到這兩種鏡像異構物都在本發明之範圍內。

**【0151】** 以游離形式或以鹽形式的具有式 (I) 的化合物的非鏡像異構物混合物或外消旋物混合物(它們的獲得可以取決於已選定的起始材料和程序)可以在該等組分的物理化學差異的基礎上，例如藉由分級結晶、蒸餾和/或層析法以已知的方式分離成純的非鏡像異構物或外消旋物。

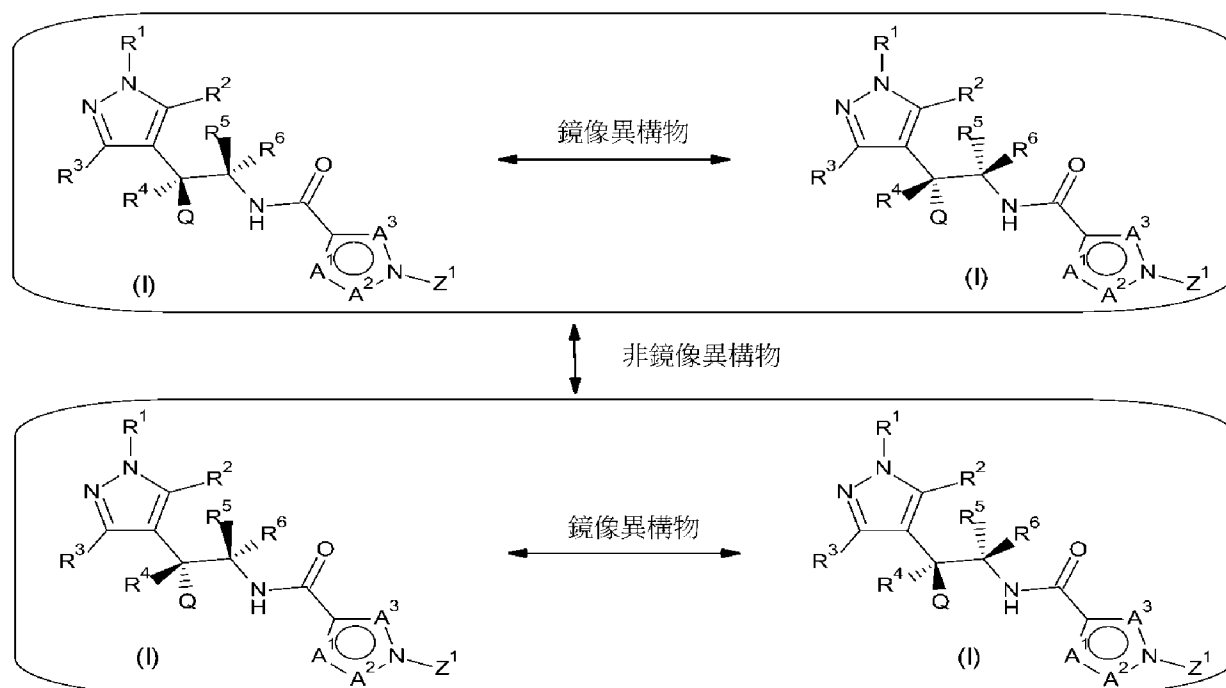
**【0152】** 能夠以類似方式獲得的鏡像異構物混合物(如外消旋物)可以藉由已知方法拆分成光學鏡像異構物，例如藉由從光學活性溶劑重結晶；藉由在手性吸附劑上的層析法，例如在乙醯纖維素上的高效液相層析法(HPLC)；借助於合適的微生物，藉由用特異性固定化酶裂解；經由形成包含化合物，例如使用手性冠醚，其中僅一個鏡像異構物被錯合；或藉由轉化成非鏡像異構物的鹽，例如藉由使鹼性最終產物外消旋物與光學活性酸(如羧酸，例如樟腦酸、酒石酸或蘋果酸，或磺酸，例如樟腦磺酸)反應，並且分離能夠以此方式獲得的非鏡像異構物混合物，例如基於其不同溶解度藉由分級結晶，從而得到非鏡像異構物，可以藉由合適的試劑(例如鹼性試劑)的作用使所希望的鏡像異構物從該等非鏡像異構物變得游離。

**【0153】** 純的非鏡像異構物或鏡像異構物能根據本發明來獲得，不僅是藉由分離適合的異構物混合物，還可以是藉由普遍已知的非鏡像異構立體選擇性或鏡像異構選擇性合成之方法，例如藉由根據本發明用具有適合的立體化學的起始材料進行該方法。

**【0154】** 如果單個組分具有不同的生物活性，有利的是在每一情況下分離或合成生物學上更有效的異構物，例如鏡像異構物或非鏡像異構物或異構物混合物，例如鏡像異構物混合物或非鏡像異構物混合物。

【0155】 作為實例，具有多於一個不對稱碳原子的化合物可以以非鏡像異構物形式存在，其可以視需要使用例如具有手性管柱的超臨界流體層析法(SFC)層析法來分離。此類非鏡像異構物可以示出不同的殺真菌活性特徵，但所有異構物和非鏡像異構物形成本發明之一部分。

【0156】 本發明之具有式 (I) 的化合物展現出兩個不對稱碳原子。具有式 (I) 的化合物的鏡像異構物與非鏡像異構物之間的關係如下所示。



【0157】 熟悉該項技術者會充分理解到上述具有式 (I) 的非鏡像異構物和鏡像異構物（其中R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、Q、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>和Z<sup>1</sup>係如對於式 (I) 所定義的）在本發明之範圍內。

【0158】 進一步地，熟悉該項技術者會充分理解到上述非鏡像異構物和鏡像異構物適用於具有式 (Ia)、(Ia-A)、(Ia-B) 和 (Ia-C) 的化合物（其中R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、A<sup>1</sup>、A<sup>2</sup>、A<sup>3</sup>、Q、R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>、R<sup>13</sup>和Z<sup>1</sup>係如對於式 (I) 所定義的）並且在本發明之範圍內。

【0159】 具有式 (I) 的化合物和適當時其互變異構物（在每種情況下以游離形式或以鹽形式）如果適當的話還能以水合物的形式獲得和/或包括其他溶劑，

例如可以用於使以固體形式存在的化合物結晶的那些。

**【0160】** 如已指示的，出人意料地，現在已經發現，出於實際目的，本發明之具有式 (I) 的化合物具有非常有利水平的用於保護植物對抗由真菌引起的病害的生物活性。

**【0161】** 根據本發明之具有式 (I) 的化合物可以在農業部門和相關使用領域中用作例如用於控制植物有害生物的活性成分，或者在非生命材料上用於控制腐敗微生物或對人潛在有害的有機體。該等新穎化合物的特徵係在低施用比率下具有優異的活性，植物耐受良好以及對環境安全。它們有非常有用的治療性的、預防性的和系統性的特性並且可以用於保護很多栽培植物。具有式 (I) 的化合物可以用於抑制或破壞在不同的有用植物作物的植物或植物部分（果實、花、葉子、莖、塊莖、根）上出現的有害生物，同時還保護了稍後生長的那些植物部分免於例如植物病原性微生物的侵害。

**【0162】** 本發明進一步關於一種用於藉由處理植物或植物繁殖材料和/或收穫的糧食作物來控制或預防易受微生物侵襲的植物或植物繁殖材料和/或收穫的糧食作物被侵染之方法，其中將有效量的根據本發明之具有式 (I) 的化合物施用於該植物、其部分或其場所。

**【0163】** 如本文使用的，當在植物或植物繁殖材料和/或收穫的糧食作物被侵染的背景下使用時，術語「控制」是指減少有害生物的數量、消除有害生物和/或預防進一步的有害生物損害，使得減少對植物或對植物衍生產品的損害。

**【0164】** 當在植物或植物繁殖材料和/或收穫的糧食作物被侵染的背景下使用時，術語「預防」是指避免由於微生物侵襲或真菌感染（真菌生長）引起的症狀。

**【0165】** 還能夠使用根據本發明之具有式 (I) 的化合物作為殺真菌劑。如本文使用的，術語「殺真菌劑」意指控制、改變、或預防真菌生長的化合物。術

語「殺真菌有效量」在使用時意指能夠對真菌生長產生影響的此種化合物或此類化合物的組合的量。控制或改變的影響包括所有從自然發育的偏離，如殺死、阻滯等，並且預防包括在植物內或植物上形成屏障或其他防禦以預防真菌侵染。

**【0166】** 還可以能夠使用根據本發明之具有式 (I) 的化合物作為用於處理植物繁殖材料（例如，種子，如果實、塊莖或穀粒）或植物插條的拌種劑，用於保護對抗真菌感染以及對抗土壤中存在的植物病原性真菌。可以在種植前用包含具有式 (I) 的化合物的組成物處理繁殖材料：例如可以在播種前拌種。還可以藉由在液體配製物中浸漬種子或藉由用固體配製物包衣它們，將具有式 (I) 的活性化合物施用至穀粒（包衣）。還可以在種植繁殖材料時，將組成物施用至種植位點，例如在播種期間施用至種子的犁溝。本發明還關於處理植物繁殖材料的此類方法，並且關於如此處理的植物繁殖材料。

**【0167】** 此外，根據本發明之具有式 (I) 的化合物可以用於控制有關領域的真菌，例如在工業材料（包括木材以及與木材有關的技術產品）的保護中、在食品儲存中、在衛生管理中。

**【0168】** 此外，本發明還可以用於保護非生命材料（例如木料、牆板和塗料）免於真菌侵襲。

**【0169】** 根據本發明之具有式 (I) 的化合物例如針對病害的真菌和真菌載體以及植物病原性的細菌和病毒係有效的。該等病害的真菌和真菌載體以及植物病原性的細菌和病毒係例如：傘枝梨頭黴、鏈格孢屬物種、絲囊黴屬物種、殼二孢屬物種、麩黴屬物種（包括黃麩黴、煙麩黴、構巢麩黴、黑麩黴、土麩黴）、短梗黴屬物種（包括出芽短梗黴（*A. pullulans*））、皮炎芽生菌、小麥白粉病菌、萵苣盤梗黴（*Bremia lactucae*）、葡萄座腔菌屬物種（包括葡萄潰瘍病菌（*B. dothidea*）、樹花地衣葡萄座腔菌（*B. obtusa*））、葡萄孢屬物種（包括灰葡萄孢（*B. cinerea*））、念珠菌屬物種（包括白色念珠菌、光滑球念珠菌（*C. glabrata*）、克魯

斯念珠菌(*C. krusei*)、萄牙念珠菌(*C. lusitaniae*)、近平滑念珠菌(*C. parapsilosis*)、熱帶念珠菌(*C. tropicalis*)、木樨屬(*Cephaloascus fragrans*)、長喙殼屬物種、尾孢屬物種(包括褐斑病菌(*C. arachidicola*))、晚斑病菌(*Cercosporidium personatum*)、枝孢黴屬物種、麥角菌、粗球孢子菌、旋孢腔菌屬物種、炭疽菌屬物種(包括香蕉炭疽病菌(*C. musae*))、新型隱球菌、間座殼屬(*Diaporthe*)物種、亞隔孢殼屬物種、內臍蠕孢屬物種、痂囊腔菌屬物種、表皮癬菌屬物種、梨火疫病菌、白粉菌屬物種(包括菊科白粉菌(*E. cichoracearum*))、葡萄頂枯病菌(*Eutypa lata*)、鐮刀菌屬物種(包括大刀鐮刀菌、禾穀鐮刀菌、朗塞斯鐮刀菌(*F. langsethiae*)、串珠鐮刀菌、膠孢鐮刀菌、茄病鐮刀菌、尖孢鐮刀菌、層出鐮刀菌)、小麥全蝕病菌(*Gaeumannomyces graminis*)、藤倉赤黴菌(*Gibberella fujikuroi*)、煤煙病菌(*Gloeodes pomigena*)、香蕉炭疽盤長孢菌(*Gloeosporium musarum*)、蘋果炭疽病菌(*Glomerella cingulate*)、葡萄球座菌(*Guignardia bidwellii*)、植物受檜膠鏽菌(*Gymnosporangium juniperi-virginianae*)、長蠕孢屬物種、駝孢鏽菌屬物種、組織胞漿菌屬物種(包括莢膜組織胞漿菌(*H. capsulatum*))、紅線病菌、束孢菌(*Leptographium lindbergi*)、辣椒白粉病菌(*Leveillula taurica*)、松針散盤殼(*Lophodermium seditiosum*)、雪黴葉枯菌(*Microdochium nivale*)、小孢子菌屬物種、鏈核盤菌屬物種、毛黴屬物種、球腔菌屬物種(包括禾生球腔菌、蘋果黑點病菌(*M. pomi*))、樹梢枯病菌、雲杉病菌、副球孢子菌屬物種、青黴屬物種(包括指狀青黴、義大利青黴)、黴樣真黴屬物種、指霜黴屬物種(包括玉蜀黍指霜黴、菲律賓霜指黴和高粱指霜黴)、霜黴屬物種、穎枯殼針孢、豆薯層鏽菌、桑黃火木針層孔菌(*Phellinus igniarius*)、瓶黴蟻屬物種、莖點黴屬物種、葡萄生擬莖點菌(*Phomopsis viticola*)、疫黴菌屬物種(包括致病疫黴菌)、單軸黴屬物種(包括霍爾斯單軸黴菌、葡萄霜黴病菌(*P. viticola*))、格孢腔菌屬物種、叉絲單囊殼屬物種(包括白叉絲單囊殼(*P. leucotricha*))、禾穀多黏菌(*Polymyxa*

graminis)、甜菜多黏菌 (*Polymyxa betae*)、小麥基腐病菌 (*Pseudocercospora herpotrichoides*)、假單胞菌屬物種、假霜黴屬物種 (包括黃瓜霜黴病菌、葎草假霜黴)、*Pseudopeziza tracheiphila* (*Pseudopeziza tracheiphila*)、霜黴屬物種 (包括大麥柄鏽菌 (*P. hordei*)、小麥葉銹病菌 (*P. recondita*)、條形柄鏽菌 (*P. Striiformis*)、小麥褐鏽菌 (*P. triticina*))、埋核盤菌屬物種、核腔菌屬物種、梨孢屬物種 (包括稻瘟病菌 (*P. oryzae*))、腐黴屬物種 (包括終極腐黴菌)、柱隔孢屬物種、絲核菌屬物種、微小根毛黴 (*Rhizomucor pusillus*)、少根根黴、喙孢屬物種、絲孢菌屬物種 (包括尖端賽多孢子菌和多育賽多孢子菌)、煤點病 (*Schizothyrium pomi*)、核盤菌屬物種、小核菌屬物種、殼針孢屬物種 (包括穎枯殼針孢 (*S. nodorum*)、小麥殼針孢 (*S. tritici*))、草莓白粉病菌 (*Sphaerotheca macularis*)、棕絲單囊殼 (*Sphaerotheca fusca*) (黃瓜白粉病菌 (*Sphaerotheca fuliginea*))、孢子絲菌屬 (*Sporothrix*) 物種、穎枯殼多孢 (*Stagonospora nodorum*)、匍柄黴屬 (*Stemphylium*) 物種、毛韌革菌 (*Stereum hirsutum*)、水稻枯紋病菌 (*Thanatephorus cucumeris*)、根串珠黴 (*Thielaviopsis basicola*)、腥黑粉菌屬物種、木黴屬物種 (包括哈茨木黴、擬康氏木黴、綠色木黴)、毛癬菌屬物種、核瑚菌屬物種、葡萄鉤絲殼、條黑粉菌屬 (*Urocystis*) 物種、黑粉菌屬 (*Ustilago*) 物種、黑星菌屬物種 (包括蘋果黑星菌 (*V. inaequalis*))、輪枝孢屬物種、以及黃單胞菌屬物種。

**【0170】** 根據本發明之具有式 (I) 的化合物可以用於例如草坪，觀賞植物，如花卉、灌木、闊葉樹木或常綠植物，例如松柏類，以及樹木注入，有害生物管理等。

**【0171】** 在本發明之範圍內，有待保護的目標作物和/或有用植物典型地包括多年生和一年生作物，如漿果植物，例如黑莓、藍莓、蔓越莓、樹莓以及草莓；穀物，例如大麥、玉米 (*maize*、*corn*)、粟、燕麥、稻、黑麥、高粱、黑小麥以及小麥；纖維植物，例如棉花、亞麻、大麻、黃麻以及劍麻；田間作物，例



如糖甜菜和飼料甜菜、咖啡豆、啤酒花、芥菜、油菜（卡諾拉）、罌粟、甘蔗、向日葵、茶以及煙草；果樹，例如蘋果、杏、鱷梨、香蕉、櫻桃、柑橘、油桃、桃、梨以及李子；草，例如百慕達草、藍草、本特草、蜈蚣草、牛毛草、黑麥草、聖奧古斯丁草以及結縷草；藥草，如羅勒、琉璃苣、細香蔥、胡荽、薰衣草、獨活草、薄荷、牛至、荷蘭芹、迷迭香、鼠尾草以及百里香；豆類，例如菜豆、小扁豆、豌豆以及大豆；堅果，例如杏仁、腰果、落花生、榛子、花生、山核桃、開心果以及核桃；棕櫚植物，例如油棕櫚；觀賞植物，例如花卉、灌木以及樹木；其他樹木，例如可可樹、椰子樹、橄欖樹以及橡膠樹；蔬菜，例如蘆筍、茄子、青花菜、捲心菜、胡蘿蔔、黃瓜、大蒜、萵苣、西葫蘆、甜瓜、秋葵、洋蔥、胡椒、馬鈴薯、南瓜、大黃、菠菜以及番茄；和藤本植物，例如葡萄。

**【0172】** 術語「有用植物」應當理解為還包括由於常規育種方法或基因工程致使其對除草劑（像溴草腈）或除草劑類（例如像HPPD抑制劑、ALS抑制劑，例如氟嘧磺隆、氟丙磺隆和三氟啶磺隆、EPSPS（5-烯醇-丙酮-莽草酸-3-磷酸-合成酶）抑制劑、GS（麩醯胺酸合成酶）抑制劑或PPO（原紫質原氧化酶）抑制劑）耐受的有用植物。已經藉由常規育種方法（誘變）致使對咪唑啉酮（例如甲氧咪草煙）耐受的作物的實例係Clearfield®夏季油菜（卡諾拉）。已經藉由基因工程方法致使對除草劑或除草劑類耐受的作物的實例包括抗草甘膦和抗草銨膦的玉米品種，該等玉米品種係以RoundupReady®、Herculex I®和LibertyLink®商標名可商購的。

**【0173】** 術語「有用植物」應當理解為還包括已經藉由使用重組DNA技術而如此轉形使其能夠合成一種或多種選擇性作用毒素的有用植物，該等毒素係如已知例如來自於產毒素細菌，尤其是芽孢桿菌屬的那些細菌。

**【0174】** 此類植物的實例係：YieldGard®（玉米品種，表現CryIA(b)毒素）；YieldGard Rootworm®（玉米品種，表現CryIIIB(b1)毒素）；YieldGard Plus®（玉

米品種，表現CryIA(b)和CryIIIB(b1)毒素)；Starlink® (玉米品種，表現Cry9(c)毒素)；Herculex I® (玉米品種，表現CryIF(a2)毒素和獲得對除草劑草銻磷銨鹽耐受性的酶磷絲菌素N-乙醯基轉移酶 (PAT))；NuCOTN 33B® (棉花品種，表現CryIA(c)毒素)；Bollgard I® (棉花品種，表現CryIA(c)毒素)；Bollgard II® (棉花品種，表現CryIA(c)和CryIIA(b)毒素)；VICOT® (棉花品種，表現VIP毒素)；NewLeaf® (馬鈴薯品種，表現CryIIIA毒素)；Nature-Gard® Agrisure® GT Advantage (GA21耐草甘膦性狀)、Agrisure® CB Advantage (Bt11玉米螟 (CB)性狀)、Agrisure® RW (玉米根蟲性狀) 以及Protecta®。

**【0175】** 術語「作物」應當理解為還包括已經使用重組DNA技術而如此轉形使其能夠合成一種或多種選擇性作用毒素的作物植物，該等毒素係如已知例如來自於產毒素細菌，尤其是芽孢桿菌屬的那些細菌。

**【0176】** 可以由此類轉基因植物表現的毒素包括例如，來自蠟樣芽孢桿菌或日本金龜子芽孢桿菌的殺昆蟲蛋白；或者來自蘇雲金芽孢桿菌的殺昆蟲蛋白，如 $\delta$ -內毒素，例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C，或者植物性殺昆蟲蛋白 (Vip)，例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A；或線蟲寄生性細菌 (例如光桿狀菌屬物種 (Photorhabdus spp.) 或致病桿菌屬物種 (Xenorhabdus spp.)，如發光桿菌 (Photorhabdus luminescens)、嗜線蟲致病桿菌 (Xenorhabdus nematophilus)) 的殺昆蟲蛋白；由動物產生的毒素，如蠍毒素、蛛毒素、蜂毒素和其他昆蟲特異性神經毒素；由真菌產生的毒素，如鏈黴菌毒素，植物凝集素類 (lectin)，如豌豆凝集素、大麥凝集素或雪花蓮凝集素；凝集素 (agglutinin)；蛋白酶抑制劑，如胰蛋白酶抑制劑、絲胺酸蛋白酶抑制劑、馬鈴薯糖蛋白、朊抑素、木瓜蛋白酶抑制劑；核糖體失活蛋白 (RIP)，如蓖麻毒素、玉蜀黍-RIP、相思豆毒素、絲瓜籽毒蛋白、皂草毒素蛋白或異株瀉根毒蛋白；類固醇代謝酶，如3-羥基類固醇氧化酶、蛻化類固醇-UDP-糖基-轉移酶、膽固醇氧

化酶、蛻皮激素抑制劑、HMG-COA-還原酶、離子通道阻斷劑如鈉通道或鈣通道阻斷劑、保幼激素酯酶、利尿激素受體、萜合成酶、聯苳合成酶、幾丁質酶和葡聚糖酶。

**【0177】** 進一步，在本發明之背景下， $\delta$ -內毒素（例如Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1或Cry9C）或植物性殺昆蟲蛋白（Vip）（例如Vip1、Vip2、Vip3或Vip3A）應理解為顯然還包括混合型毒素、截短的毒素和經修飾的毒素。混合型毒素係藉由那些蛋白的不同結構域的新組合重組產生的（參見例如，WO 2002/015701）。截短的毒素，例如截短的Cry1Ab係已知的。在經修飾的毒素的情況下，天然存在的毒素的一個或多個胺基酸被替代。在此類胺基酸替代中，較佳的是將非天然存在的蛋白酶識別序列插入毒素中，例如像在Cry3A055的情況下，組織蛋白酶-G-識別序列被插入Cry3A毒素中（參見WO 2003/018810）。

**【0178】** 此類毒素或能夠合成此類毒素的轉基因植物的實例揭露於例如EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878以及WO 2003/052073中。

**【0179】** 用於製備此類轉基因植物之方法通常是熟悉該項技術者已知的並且描述在例如以上提及的公開物中。CryI型去氧核糖核酸及其製備例如從WO 95/34656、EP-A-0 367 474、EP-A-0 401 979和WO 90/13651中已知。

**【0180】** 包含在轉基因植物中的毒素使得植物對有害昆蟲有耐受性。此類昆蟲可以存在於任何昆蟲分類群但尤其常見於甲蟲（鞘翅目（Coleoptera））、雙翅昆蟲（雙翅目（Diptera））和蝴蝶（鱗翅目（Lepidoptera））。

**【0181】** 包含一種或多種編碼殺昆蟲劑抗性並且表現一種或多種毒素的基因的轉基因植物係已知的並且其中一些係可商購的。此類植物的實例係：YieldGard®（玉米品種，表現Cry1Ab毒素）；YieldGard Rootworm®（玉米品種，

表現Cry3Bb1毒素); YieldGard Plus® (玉米品種, 表現Cry1Ab和Cry3Bb1毒素); Starlink® (玉米品種, 表現Cry9C毒素); Herculex I® (玉米品種, 表現Cry1Fa2毒素和獲得對除草劑草銨磷銨鹽耐受性的酶磷絲菌素N-乙醯基轉移酶 (PAT)); NuCOTN 33B® (棉花品種, 表現Cry1Ac毒素); Bollgard I® (棉花品種, 表現Cry1Ac毒素); Bollgard II® (棉花品種, 表現Cry1Ac和Cry2Ab毒素); VipCot® (棉花品種, 表現Vip3A和Cry1Ab毒素); NewLeaf® (馬鈴薯品種, 表現Cry3A毒素); NatureGard®、Agrisure® GT Advantage (GA21耐草甘膦性狀)、Agrisure® CB Advantage (Bt11玉米螟 (CB) 性狀) 以及Protecta®。

**【0182】** 此類轉基因作物的另外的實例係：

1. Bt11玉米, 來自先正達種子公司 (Syngenta Seeds SAS), 霍比特路 (Chemin de l'Hobit) 27, F-31 790 聖蘇維爾 (St. Sauveur), 法國, 登記號C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉米, 藉由轉基因表現截短的Cry1Ab毒素, 使之能抵抗歐洲玉米螟 (玉米螟和粉莖螟) 的侵襲。Bt11玉米還轉基因表現PAT酶以獲得對除草劑草銨磷銨鹽的耐受性。

2. Bt176玉米, 來自先正達種子公司, 霍比特路27, F-31 790 聖蘇維爾, 法國, 登記號C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉米, 藉由轉基因表現Cry1Ab毒素, 使之能抵抗歐洲玉米螟 (玉米螟和粉莖螟) 的侵襲。Bt176玉米還轉基因表現PAT酶以獲得對除草劑草銨磷銨鹽的耐受性。

3. MIR604玉米, 來自先正達種子公司, 霍比特路27, F-31 790 聖蘇維爾, 法國, 登記號C/FR/96/05/10。藉由轉基因表現經修飾的Cry3A毒素使之具有昆蟲抗性的玉米。此毒素係藉由插入組織蛋白酶-G-蛋白酶識別序列而經修飾的Cry3A055。此類轉基因玉米植物的製備描述於WO 2003/018810中。

4. MON 863玉米, 來自孟山都歐洲公司 (Monsanto Europe S.A.), 270-272 特弗倫大道 (Avenue de Tervuren), B-1150布魯塞爾, 比利時, 登記號C/DE/02/9。

MON 863表現Cry3Bb1毒素，並且對某些鞘翅目昆蟲有抗性。

5. IPC 531棉花，來自孟山都歐洲公司270-272特弗倫大道，B-1150布魯塞爾，比利時，登記號C/ES/96/02。

6. 1507玉米，來自先鋒海外公司 (Pioneer Overseas Corporation)，特德斯科大道 (Avenue Tedesco)，7 B-1160 布魯塞爾，比利時，登記號C/NL/00/10。遺傳修飾的玉米，表現蛋白質Cry1F以獲得對某些鱗翅目昆蟲的抗性，並且表現PAT蛋白質以獲得對除草劑草銨磷銨鹽的耐受性。

7. NK603 × MON 810玉米，來自孟山都歐洲公司 270-272特弗倫大道，B 1150布魯塞爾，比利時，登記號C/GB/02/M3/03。藉由將遺傳修飾的品種NK603和MON 810雜交，由常規育種的雜交玉米品種構成。NK603 × MON 810玉米轉基因地表現由土壤桿菌屬菌株CP4獲得的蛋白質CP4 EPSPS，使之耐除草劑Roundup® (含有草甘膦)，以及還有由蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克亞種獲得的Cry1Ab毒素，使之耐某些鱗翅目昆蟲，包括歐洲玉米螟。

**【0183】** 根據本發明之具有式 (I) 的化合物可用於控制或預防植物病原性病害，特別是植物病原性真菌，如在水果、蔬菜和馬鈴薯上的鏈格孢菌；在草莓、番茄、向日葵、豆類作物、蔬菜以及葡萄上的灰葡萄孢菌；在馬鈴薯和蔬菜上的立枯絲核菌；在葡萄上的葡萄鉤絲殼；在瓜類上的枝孢黴、瓜類蔓枯病菌、白粉病菌和瓜球病菌；在瓜類和茄果類作物上的牛尾線蟲；在穀物上的鐮刀菌屬物種；在穀物上的小球腔菌屬物種 (Leptosphaeria spp.)；以及在穀物上的酵母屬物種。

**【0184】** 如本文使用的，術語「場所」意指植物在其中或其上生長的地方，或栽培植物的種子被播種的地方，或者種子將要被置於土壤中的地方。它包括土壤、種子以及幼苗，連同建立的植被。

**【0185】** 術語「植物」是指植物的所有有形部分，包括種子、幼苗、幼樹、

根、塊莖、莖、稈、葉子和果實。

【0186】 術語「植物繁殖材料」應當理解為表示植物的生殖部分，如種子，該等部分可以用於植物的繁殖，以及營養性材料，如插條或塊莖（例如馬鈴薯）。可以提及例如種子（在嚴格意義上）、根、果實、塊莖、球莖、根莖以及植物的部分。還可以提及在發芽後或在出苗後將被移植的發芽植物和幼小植物。該等幼小植物可以藉由浸漬進行完全或部分處理而在移植之前進行保護。較佳的是，「植物繁殖材料」應理解為表示種子。

【0187】 根據本發明之具有式 (I) 的化合物可以以未修飾的形式使用，或者較佳的是，連同配製物領域中常規採用的佐劑一起使用。為此目的，它們可以按已知方式便利地配製為可乳化濃縮物、可包衣的糊劑、直接可噴霧的或可稀釋的溶液或懸浮液、稀釋乳液、可濕性粉劑、可溶性粉劑、塵粉劑、顆粒以及還有膠囊，例如在聚合物質中。對於組成物的類型，根據預期目的以及當時環境來選擇施用方法，如噴霧、霧化、撒粉、撒播、塗抹或澆灌。組成物還可以含有另外的佐劑，如穩定劑、消泡劑、黏度調節劑、黏合劑或增黏劑，連同肥料、微量營養素供體或其他用於獲得特殊效果的配製物。

【0188】 合適的載體和佐劑，例如，用於農業用途，可以是固體或液體並且是在配製物技術中有用的物質，例如天然或再生的礦物物質、溶劑、分散體、濕潤劑、增黏劑、增稠劑、黏合劑、或肥料。此類載體例如描述在WO 97/33890中。

【0189】 懸浮液濃縮物係活性化合物的精細分散的固體顆粒懸浮於其中的水性配製物。此類配製物包含抗沈降劑和分散劑，並且可以進一步包含濕潤劑以增強活性，以及消泡劑和晶體生長抑制劑。在使用時，將該等濃縮物在水中稀釋，並且通常作為噴霧劑施用至有待處理的區域。活性成分的量的範圍可以是從該濃縮物的0.5%至95%。

**【0190】** 可濕性粉劑係以在水中或其他液態載體中容易分散的精細分散的顆粒形式。該等顆粒含有保留在固體基質中的活性成分。典型的固體基質包括漂白土、高嶺土、矽石和其他容易濕化的有機或無機固體。可濕性粉劑通常含有從5%至95%的活性成分加上少量的濕潤劑、分散劑或乳化劑。

**【0191】** 可乳化濃縮物係在水中或其他液體中可分散的均勻的液體組成物並且可以完全由活性化合物與液體或固體乳化劑組成，或者還可以含有液態載體，如二甲苯、重芳烴石腦油、異佛耳酮和其他不揮發的有機溶劑。在使用時，將該等濃縮物分散在水中或其他液體中，並且通常作為噴霧劑施用至有待處理的區域。活性成分的量的範圍可以是從該濃縮物的0.5%至95%。

**【0192】** 顆粒配製物包括擠出物和較粗顆粒兩者，並且通常在不稀釋的情況下施用至需要處理的區域。用於顆粒配製物的典型載體包括砂、漂白土、鎂鋁海泡石黏土、膨潤土、蒙脫土、蛭石、珍珠岩、碳酸鈣、磚、浮石、葉蠟石、高嶺土、白雲石、灰泥、木粉、碎玉米穗軸、碎花生殼、糖、氯化鈉、硫酸鈉、矽酸鈉、硼酸鈉、氧化鎂、雲母、氧化鐵、氧化鋅、氧化鈦、氧化錒、冰晶石、石膏、矽藻土、硫酸鈣以及其他有機或無機的吸收活性化合物或可被活性化合物包衣的材料。顆粒配製物通常含有5%至25%的活性成分，該等活性成分可以包括表面活性劑如重芳烴石腦油、煤油和其他石油餾分，或植物油；和/或黏著劑如糊精、膠（glue）或合成樹脂。

**【0193】** 粉塵劑係活性成分與精細分散的固體（如滑石、黏土、麵粉以及其他有機與無機的作為分散劑和載體的固體）的自由流動的混合物。

**【0194】** 微囊典型地是包裹在惰性多孔殼內的活性成分的微滴或顆粒，該惰性多孔殼允許以可控的速率讓包住的材料逃逸到環境中。包裹的微滴的直徑典型地為1至50微米。包裹的液體典型地占膠囊的重量的50%至95%並且除了活性化合物外還可以包含溶劑。包裹的顆粒通常是多孔顆粒，其中多孔膜將顆粒孔

口密封，將活性物種以液體形式保留在顆粒孔內部。顆粒的直徑的範圍典型地是從1毫米至1釐米並且較佳的是1毫米至2毫米。顆粒藉由擠出、凝聚或製粒形成，或者係天然存在的。此類材料的實例係蛭石、燒結黏土、高嶺土、鎂鋁海泡石黏土、鋸屑和碳精粒。殼或膜材料包括天然和合成橡膠、纖維材料、苯乙烯-丁二烯共聚物、聚丙烯腈、聚丙烯酸酯、聚酯、聚醯胺、聚脲、聚胺酯和澱粉黃原酸酯。

**【0195】** 用於農用化學應用的其他有用配製物包括活性成分在溶劑(如丙酮、烷基化萘、二甲苯和其他有機溶劑)中的簡單溶液，在該溶劑中活性成分以所希望的濃度完全溶解。也可以使用加壓的噴霧劑，其中由於低沸點分散劑溶劑載體的蒸發，所述活性成分以精細分散的形式分散。

**【0196】** 在上述配製物類型中對於配製本發明之組成物有用的合適的農業佐劑和載體係熟悉該項技術者熟知的。

**【0197】** 可以採用的液態載體包括例如水、甲苯、二甲苯、石腦油、作物油、丙酮、甲基乙基酮、環己酮、乙酸酐、乙腈、乙醯苯、乙酸戊酯、2-丁酮、氯苯、環己烷、環己醇、乙酸烷基酯、二丙酮醇、1,2-二氯丙烷、二乙醇胺、對二乙基苯、二甘醇、松香酸二甘醇酯、二甘醇丁醚、二甘醇乙醚、二甘醇甲醚、N,N-二甲基甲醯胺、二甲基亞砷、1,4-二噁烷、二丙二醇、二丙二醇甲醚、二丙二醇二苯甲酸酯、二丙二醇(diproxitol)、烷基吡咯啉酮、乙酸乙酯、2-乙基己醇、碳酸仲乙酯、1,1,1-三氯乙烷、2-庚酮、 $\alpha$ -蒎烯、d-蒎烯、乙二醇、乙二醇丁醚、乙二醇甲醚、 $\gamma$ -丁內酯、甘油、甘油二乙酸酯、甘油單乙酸酯、甘油三乙酸酯、十六烷、己二醇、乙酸異戊酯、乙酸異冰片(bornyl)酯、異辛烷、異佛耳酮、異丙苯、肉豆蔻酸異丙酯、乳酸、月桂胺、亞異丙基丙酮、甲氧基丙醇、甲基異戊酮、甲基異丁基酮、月桂酸甲酯、辛酸甲酯、油酸甲酯、二氯甲烷、間二甲苯、正己烷、正辛胺、十八酸、乙酸辛胺酯、油酸、油胺、鄰二甲苯、苯酚、聚乙二



醇 (PEG400)、丙酸、丙二醇、丙二醇單甲醚、對二甲苯、甲苯、磷酸三乙酯、三甘醇、二甲苯磺酸、石蠟、礦物油、三氯乙烯、全氯乙烯、乙酸乙酯、乙酸戊酯、乙酸丁酯、甲醇、乙醇、異丙醇、以及更高分子量的醇類 (如戊醇、四氫糠醇、己醇、辛醇等)、乙二醇、丙二醇、甘油以及N-甲基-2-吡咯啉酮。水通常是用以稀釋濃縮物的選用載體。

**【0198】** 合適的固體載體包括例如滑石、二氧化鈦、葉蠟石黏土、矽石、鎂鋁海泡石黏土、矽藻土 (kieselguhr)、白堊、矽藻土 (diatomaceous earth)、石灰石、碳酸鈣、膨潤土、漂白土、棉子殼、小麥粉、大豆粉、浮石、木粉、核桃殼粉以及木質素。

**【0199】** 在所述液體和固體組成物中有利地採用廣泛的表面活性劑，尤其是被設計為在施用前用載體稀釋的那些。該等試劑在使用時通常占配製物重量的從0.1%至15%。它們在性質上可以是陰離子的、陽離子的、非離子的或聚合的並且可以作為乳化劑、濕潤劑、懸浮劑或以其他目的採用。典型的表面活性劑包括烷基硫酸鹽，如月桂基硫酸二乙醇銨；烷基芳基磺酸鹽，如十二烷基苯磺酸鈣；烷基酚-環氧烷加成產物，如壬基酚-C.sub.18乙氧基化物；醇-環氧烷加成產物，如十三烷醇-C.sub.16乙氧基化物；皂，如硬脂酸鈉；烷基萘磺酸鹽，如二丁基萘磺酸鈉；磺基琥珀酸二烷基酯的鹽，如二(2-乙基己基)磺基琥珀酸鈉；山梨糖醇酯，如山梨糖醇油酸酯；季胺，如月桂基三甲基氯化銨；脂肪酸的聚乙二醇酯，如聚乙二醇硬脂酸酯；環氧乙烷和環氧丙烷的嵌段共聚物；以及磷酸單和二烷基酯的鹽。

**【0200】** 通常在農業組成物中使用的其他佐劑包括結晶抑制劑、黏度調節劑、懸浮劑、噴霧液滴調節劑、顏料、抗氧化劑、發泡劑、消泡劑、遮光劑、相容性試劑、消泡劑、鉗合劑、中和劑和緩衝劑、腐蝕抑制劑、染料、氣味劑、鋪展劑、滲透助劑、微量營養素、柔潤劑、潤滑劑以及固著劑。

【0201】 此外，進一步地，其他殺生物的活性成分或組成物可以與本發明之組成物組合，並且用於本發明之方法中並且與本發明之組成物同時地或相繼地施用。當同時施用時，該等另外的活性成分可以連同本發明之組成物一起配製或混合於例如噴霧罐中。該等另外的殺生物的活性成分可以是殺真菌劑、除草劑、殺昆蟲劑、殺細菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑和/或植物生長調節劑。

【0202】 本文中使用了其俗名提及的殺有害生物劑係，例如，從「The Pesticide Manual [殺有害生物劑手冊]」，第15版，英國作物保護委員會（British Crop Protection Council）2009已知的。

【0203】 此外，本發明之組成物還可以與一種或多種系統獲得性抗性誘導劑（「SAR」誘導劑）一起施用。SAR誘導劑係已知的並且描述於例如美國專利案號US 6,919,298中，並且包括例如水楊酸鹽以及商用的SAR誘導劑阿拉酸式苯-S-甲基。

【0204】 根據本發明之具有式 (I) 的化合物通常以農用化學組成物的形式使用並且可以與另外的化合物同時地或相繼地施用至有待處理的作物區域或植物。例如，該等另外的化合物可以是影響植物生長的肥料或微量營養素供體或其他製劑。它們還可以是選擇性除草劑或非選擇性除草劑，連同殺昆蟲劑、殺真菌劑、殺細菌劑、殺線蟲劑、殺軟體動物劑或該等製劑中的幾種的混合物，如果希望的話連同配製物領域中通常使用的另外的載體、表面活性劑或促進施用的佐劑一起。

【0205】 根據本發明之具有式 (I) 的化合物可以以用於控制或保護對抗植物病原性微生物的（殺真菌的）組成物的形式使用，該等組成物包含作為活性成分的至少一種具有式 (I) 的化合物或至少一種較佳的如本文所定義的單獨化合物（以游離形式或以農用化學上可用的鹽形式）和至少一種上述佐劑。

【0206】 因此，本發明提供了包含至少一種根據本發明之具有式 (I) 的化

合物、農業上可接受的載體和視需要佐劑的組成物、較佳的是殺真菌組成物。農業上可接受的載體係例如適合農業用途的載體。農業載體在本領域係熟知的。較佳的是，除了具有式 (I) 的化合物外，所述組成物還可以包含至少一種或多種殺有害生物活性化合物，例如另外的殺真菌活性成分。

**【0207】** 根據本發明之具有式 (I) 的化合物可以是組成物的唯一活性成分，或者適當時它可以與一種或多種另外的活性成分（如殺有害生物劑、殺真菌劑、增效劑、除草劑或植物生長調節劑）混合。在一些情況下，另外的活性成分可以產生出乎意料的協同活性。

**【0208】** 合適的另外的活性成分的實例包括以下：無環胺基酸（acycloamino acid）殺真菌劑、脂肪族氮殺真菌劑、醯胺殺真菌劑、苯胺殺真菌劑、抗生素殺真菌劑、芳香族殺真菌劑、含砷殺真菌劑、芳基苯基酮殺真菌劑、苯甲醯胺殺真菌劑、苯甲醯苯胺殺真菌劑、苯并咪唑殺真菌劑、苯并噻唑殺真菌劑、植物殺真菌劑、橋聯聯苯基殺真菌劑、胺基甲酸酯殺真菌劑、苯胺甲酸酯殺真菌劑、康唑殺真菌劑、銅殺真菌劑、二甲醯亞胺殺真菌劑、二硝基苯酚殺真菌劑、二硫代胺基甲酸酯殺真菌劑、二硫戊環殺真菌劑、糠醯胺殺真菌劑、糠苯胺殺真菌劑、醯肼真菌劑、咪唑殺真菌劑、汞殺真菌劑、咪啉殺真菌劑、有機磷殺真菌劑、有機錫殺真菌劑、氧硫雜環己二烯（oxathiin）殺真菌劑、呋唑殺真菌劑、苯硫醯胺殺真菌劑、多硫化物殺真菌劑、吡唑殺菌劑、吡啶殺真菌劑、嘧啶殺真菌劑、吡咯殺真菌劑、季銨殺真菌劑、喹啉殺真菌劑、醌殺真菌劑、喹啉殺真菌劑、嗜球果傘素殺真菌劑、磺醯苯胺（sulfonanilide）殺真菌劑、噻二唑殺真菌劑、噻唑殺真菌劑、四氫噻唑殺真菌劑、硫代胺基甲酸酯殺真菌劑、噻吩殺真菌劑、三殺真菌劑、三唑殺真菌劑、三唑并嘧啶殺真菌劑、尿素殺真菌劑、纈胺醯胺（valinamide）殺真菌劑、以及鋅殺真菌劑。

**【0209】** 合適的另外的活性成分的實例包括以下：石油油料、1,1-雙(4-氯

苯基)-2-乙氧基乙醇、2,4-二氯苯基苯磺酸酯、2-氟-N-甲基-N-1-萘乙醯胺、4-氯  
 苯基苯基砒、乙醯蟲脞、涕滅虱威、賽果、果滿磷、胺吸磷、草酸氫胺吸磷、雙  
 甲脒、殺蟻特、三氧化二砷、偶氮苯、偶氮磷、苯菌靈、苯諾沙磷 (benoxa-fos)、  
 苯甲酸苄酯、聯苯吡菌胺、溴滅菊酯、溴烯殺、溴硫磷、溴蟻酯、噻酮、丁酮威、  
 丁酮虱威、丁基噻蟻靈、多硫化鈣、毒殺芬、氯滅殺威、三硫磷、蟻蟬胺、滅蟻  
 猛、氯殺蟻、殺蟲脒、殺蟲脒鹽酸鹽、殺蟻醇、殺蟻酯、敵蟻特、乙酯殺蟻醇、  
 滅蟻脒 (chloromebuform)、滅蟲脒、丙酯殺蟻醇、蟲蟻磷、瓜菊酯I、瓜菊酯II、  
 瓜菊酯、克羅散泰、蠅毒磷、克羅米通、巴毒磷、硫雜靈、果蟲磷、DCPM、DDT、  
 田樂磷、田樂磷-O、田樂磷-S、內吸磷-甲基、內吸磷-O、內吸磷-O-甲基、內吸  
 磷-S、內吸磷-S-甲基、內吸磷-S-甲基砒、抑菌靈、敵敵畏、二克磷 (dicliphos)、  
 除蟻靈、甲氟磷、消蟻酚 (dinx)、消蟻酚 (dinx-diclexine)、敵蟻普-4、敵蟻普  
 -6、鄰敵蟻消、硝戊酯、硝辛酯、硝丁酯、敵殺磷、磺基二苯、戒酒硫、DNOC、  
 苯氧炔蟻 (dofenapyn)、朵拉克汀、因毒磷、依立諾克丁、益硫磷、乙噻硫磷、  
 抗蟻唑、苯丁錫、苯硫威、吡蟻胺 (fenpyrad)、啞蟻酯、胺苯吡菌酮、除蟻酯、  
 氟硝二苯胺 (fentrifanil)、氟蟻噻、氟蟻脒、聯氟蟻、氟殺蟻、FMC 1137、伐蟲  
 脒、伐蟲脒鹽酸鹽、胺甲威 (formparanate)、 $\gamma$ -HCH、果綠定、苄蟻醚、十六烷  
 基環丙烷羧酸酯、水胺硫磷、茉莉菊酯I、茉莉菊酯II、碘硫磷、林丹、丙蟻氰、  
 滅蚜磷、二噻磷、甲硫芬、蟲蟻畏、溴甲烷、速滅威、自克威、米爾貝肱、丙胺  
 氰、久效磷、茂果、莫昔克丁、二溴磷 (naled)、4-氯-2-(2-氯-2-甲基-丙基)-5-[(6-  
 碘-3-吡啶基)甲氧基]嗒吡-3-酮、氟蟻靈、尼可黴素、戊氰威、戊氰威1:1氯化鋅  
 錯合物、氧樂果、亞異砒磷、砒拌磷、pp'-DDT、對硫磷、苄氯菊酯、芬硫磷、  
 伏殺磷、硫環磷、磷胺、氯化松節油 (polychloroterpenes)、殺蟻素 (polynactins)、  
 丙氯諾、蟬虱威、殘殺威、乙噻唑磷、發硫磷、除蟲菊酯I、除蟲菊酯II、除蟲菊  
 酯、嗒硫磷、噻硫磷、喹硫磷 (quinalphos)、喹硫磷 (quintiofos)、R-1492、甘

胺硫磷、魚藤酮、八甲磷、克線丹、司拉克丁、蘇硫磷、SSI-121、舒非侖、氟蟲  
 胺、硫特普、硫、氟磷吡、 $\tau$ -氟胺氰菊酯、TEPP、叔丁威、四氯殺蟎磷、殺蟎好、  
 噻吩諾 (thiafenox)、抗蟲威、久效威、甲基乙拌磷、克殺蟎、蘇力菌素、威菌  
 磷、苯蟎噻、三唑磷、滅蚜唑 (triazuron)、三氯丙氧磷、三活菌素、蚜滅多、甲  
 烯氟蟲腈 (vaniliprole)、百殺辛 (bethoxazin)、二辛酸銅、硫酸銅、環丁腈  
 (cybutryne)、二氯萘醌、雙氯酚、菌多酸、三苯錫、熟石灰、代森鈉、滅藻醌、  
 醌苄胺、西瑪津、三苯基乙酸錫、三苯基氫氧化錫、育畜磷、哌、托布津、氯醛  
 糖、倍硫磷、吡啶-4-胺、士的寧、1-羥基-1H-吡啶-2-硫酮、4-(喹啉-2-基氨基)  
 苯磺醯胺、8-羥基喹啉硫酸鹽、溴硝醇、氫氧化銅、甲酚、雙吡硫翁、多地辛、  
 敵磺鈉、甲醛、汞加芬、春雷黴素、春雷黴素鹽酸鹽水合物、二(二甲基二硫代  
 胺基甲酸)鎳、三氯甲基吡啶、辛噻酮、奧索利酸、土黴素、羥基喹啉硫酸鉀、  
 噻菌靈、鏈黴素、鏈黴素倍半硫酸鹽、葉枯酞、硫柳汞、棉褐帶卷蛾GV、放射  
 形土壤桿菌、鈍綫蟎屬物種、芹菜夜蛾NPV、原櫻翅繭小蜂、短距蚜小蜂、棉蚜  
 寄生蜂、食蚜瘿蚊、苜蓿銀紋夜蛾NPV、球形芽孢桿菌、布氏白僵菌、普通草蛉、  
 孟氏隱唇瓢蟲、蘋果蠹蛾GV、西伯利亞離顎繭蜂、豌豆潛葉蠅姬小蜂、麗蚜小  
 蜂、槲角蚜小蜂、嗜菌異小桿線蟲和大異小桿線蟲、斑長足瓢蟲、橘粉介殼蟲寄  
 生蜂、盲蝽、甘藍夜蛾NPV、黃闊柄跳小蜂、黃綠綠僵菌、金龜子綠僵菌小孢變  
 種、歐洲新松葉蜂NPV和紅頭新松葉蜂NPV、小花蝽屬物種、玫煙色擬青黴、智  
 利小植綫蟎、毛蚊線蟲、小卷蛾斯氏線蟲、夜蛾斯氏線蟲、格氏線蟲、銳比斯氏  
 線蟲、裡氏斯氏線蟲 (Steinernema riobravis)、螻蛄斯氏線蟲、斯氏線蟲屬物種、  
 赤眼蜂屬物種、西方盲走蟎、蠟蚧輪枝菌、唑磷吡、雙(氮丙啶)甲胺基磷硫化物、  
 白消安、迪麥替夫、六甲蜜胺、六甲磷、甲基涕巴、甲硫涕巴、甲基唑磷吡、不  
 孕啶、氟幼脲、涕巴、硫代六甲磷、硫涕巴、曲他胺、尿烷亞胺、(E)-癸-5-烯-1-  
 基乙酸酯與(E)-癸-5-烯-1-醇、(E)-十三碳-4-烯-1-基乙酸酯、(E)-6-甲基庚-2-烯-4-

醇、(E,Z)-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯、(Z)-十二碳-7-烯-1-基乙酸酯、(Z)-十六碳-11-烯醛、(Z)-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯、(Z)-十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯、(Z)-二十-13-烯-10-酮、(Z)-十四碳-7-烯-1-醛、(Z)-十四碳-9-烯-1-醇、(Z)-十四碳-9-烯-1-基乙酸酯、(7E,9Z)-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯、(9Z,11E)-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸酯、(9Z,12E)-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯、14-甲基十八碳-1-烯、4-甲基壬-5-醇與4-甲基壬-5-酮、 $\alpha$ -多紋素、西部松小蠹集合資訊素、十二碳二烯醇、可得蒙、誘蠅酮、環氧十九烷、十二碳-8-烯-1-基乙酸酯、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯、十二碳-8,10-二烯-1-基乙酸酯、多明尼克魯爾 (dominicalure)、4-甲基辛酸乙酯、丁香酚、南部松小蠹集合資訊素、誘殺烯混劑、誘殺烯混劑I、誘殺烯混劑II、誘殺烯混劑III、誘殺烯混劑IV、己誘劑、齒小蠹二烯醇、小蠹烯醇、金龜子性誘劑、三甲基二氧三環壬烷、夜蛾誘劑 (lilture)、粉紋夜蛾性誘劑、誘殺酯、蒙托麼克酸 (megatomoic acid)、誘蟲醚、誘蟲烯、十八碳-2,13-二烯-1-基乙酸酯、十八碳-3,13-二烯-1-基乙酸酯、賀康彼、椰蛀犀金龜聚集資訊素、非樂康、誘蟲環、索迪叮 (sordidin)、食菌甲誘醇、十四碳-11-烯-1-基乙酸酯、地中海實蠅引誘劑、地中海實蠅引誘劑A、地中海實蠅引誘劑B1、地中海實蠅引誘劑B2、地中海實蠅引誘劑C、創特嶠 (創特嶠)、2-(辛基硫代)-乙醇、避蚊酮、丁氧基(聚丙二醇)、己二酸二丁酯、鄰苯二甲酸二丁酯、丁二酸二丁酯、避蚊胺、驅蚊靈、鄰苯二甲酸二甲酯、乙基己二醇、己脲、甲嗒丁、甲基新癸醯胺、草胺酸鹽、派卡瑞丁、1-二氯-1-硝基乙烷、1,1-二氯-2,2-二(4-乙基苯基)-乙烷、1,2-二氯丙烷與1,3-二氯丙烯、1-溴-2-氯乙烷、2,2,2-三氯-1-(3,4-二氯苯基)乙基乙酸酯、2,2-二氯乙烯基2-乙基亞磺醯基乙基甲基磷酸酯、2-(1,3-二硫戊環-2-基)苯基二甲基胺基甲酸酯、2-(2-丁氧基乙氧基)乙基硫氰酸酯、2-(4,5-二甲基-1,3-二氧戊環-2-基)苯基甲基胺基甲酸酯、2-(4-氯-3,5-二甲苯基氧基)乙醇、2-氯乙烯基二乙基磷酸酯、2-咪唑啉酮、2-異戊醯二氫茛-1,3-二酮、2-甲基(丙-2-炔基)胺基苯基甲基胺基甲

酸酯、2-氰硫基乙基月桂酸酯、3-溴-1-氯丙-1-烯、3-甲基-1-苯基吡唑-5-基二甲基-胺基甲酸酯、4-甲基(丙-2-炔基)胺基-3,5-二甲苯基甲基胺基甲酸酯、5,5-二甲基-3-側氧基環己-1-烯基二甲基胺基甲酸酯、阿賽硫磷、丙烯腈、艾氏劑、阿洛胺菌素、除害威、 $\alpha$ -蛻皮激素、磷化鋁、滅害威、新菸鹼、乙基殺撲磷(athidathion)、甲基吡啶磷、蘇雲金芽孢桿菌 $\delta$ -內毒素、六氟矽酸鋇、多硫化鋇、熏菊酯、拜耳22/190、拜耳22408、 $\beta$ -氟氯氰菊酯、 $\beta$ -氯氰菊酯、戊環苄呋菊酯(bioethanomethrin)、生物氯菊酯、雙(2-氯乙基)醚、硼砂、溴苯烯磷、溴-DDT、合殺威、畜蟲威、特嘧硫磷(butathiofos)、丁酯磷、砷酸鈣、氰化鈣、二硫化碳、四氯化碳、巴丹鹽酸鹽、瑟瓦定(cevadine)、冰片丹、氯丹、十氯酮、氯仿、氯化苦、氯膦肟磷、氯吡唑磷(chlorprazophos)、順式苄呋菊酯(cis-resmethrin)、順式苄呋菊酯(cismethrin)、氰菊酯(clocythrins)、乙醯亞砷酸銅、砷酸銅、油酸銅、畜蟲磷(coumithoate)、冰晶石、CS 708、苯腈磷、殺螟腈、環蟲菊、賽滅磷、d-胺菊酯、DAEP、棉隆、脫甲基克百威(decarbofuran)、除線特、異氯磷、除線磷、迪克萊賽爾(dicresyl)、環蟲腈、狄氏劑、二乙基5-甲基吡唑-3-基磷酸酯、喘定(dior)、四氟甲醚菊酯、地麥威、苄菊酯、甲基毒蟲畏、敵蠅威、丙硝酚、戊硝酚、地樂酚、苯蟲醚、蔬果磷、噻喃磷、DSP、脫皮甾酮、EI 1642、EMPC、EPBP、郡丙硫磷(etaphos)、乙硫苯威、甲酸乙酯、二溴乙烷、二氯乙烷、環氧乙烷、EXD、皮蠅磷、乙苯威、殺螟硫磷、氧嘧啶胺(fenoxacrim)、吡氯氰菊酯、豐索磷、乙基倍硫磷、氟氯雙苯隆(flucofuron)、丁苯硫磷、磷砒酯、丁環硫磷、呋線威、抗蟲菊、雙胍辛鹽、雙胍辛乙酸鹽、四硫代碳酸鈉、苄蟻醚、HCH、HEOD、七氯、速殺硫磷、HHDN、氰化氫、喹啉威、IPSP、氯唑磷、碳氯靈、異艾氏劑、異柳磷、移栽靈、稻瘟靈、惡唑磷、保幼激素I、保幼激素II、保幼激素III、氯戊環、烯蟲炔酯、砷酸鉛、溴苯磷、啶蟲磷、噻唑磷、間異丙苯基甲基胺基甲酸酯、磷化鎂、疊氮磷、甲基滅蚜磷、滅蚜硫磷、氯化亞汞、甲亞砷磷、

威百敏、威百敏鉀鹽、威百敏鈉鹽、甲基磺醯氟、丁烯胺磷、甲氧普林、甲醚菊酯、甲氧滴滴涕、異硫氰酸甲酯、甲基氯仿、二氯甲烷、惡蟲酮、滅蟻靈、奈肽磷、萘、NC-170、菸鹼、硫酸菸鹼、硝蟲噻、原菸鹼、O-5-二氯-4-碘苯基O-乙基乙基硫代磷酸酯、O,O-二乙基O-4-甲基-2-側氧基-2H-苯并哌喃-7-基硫代磷酸酯、O,O-二乙基O-6-甲基-2-丙基嘧啶-4-基硫代磷酸酯、O,O,O',O'-四丙基二硫代焦磷酸酯、油酸、對-二氯苯、甲基對硫磷、五氯苯酚、月桂酸五氯苯酯、PH 60-38、芬硫磷、對氯硫磷、磷化氫、甲基辛硫磷、甲胺嘧磷、多氯二環戊二烯異構物、亞砷酸鉀、硫氰酸鉀、早熟素I、早熟素II、早熟素III、醯胺嘧啶磷、丙氟菊酯、猛殺威、丙硫磷、吡菌磷、反滅蟲菊、苦木萃取物 (quassia)、噠硫磷-甲基、畜寧磷、碘柳胺、苧呔菊脂、魚藤酮、噠噠菊酯、魚尼汀、利阿諾定、沙巴藜蘆 (sabadilla)、八甲磷、克線丹、SI-0009、噠丙腈、亞砷酸鈉、氰化鈉、氟化鈉、六氟矽酸鈉、五氯苯酚鈉、硒酸鈉、硫氰酸鈉、磺苯醚隆 (sulcofuron)、磺苯醚隆鈉鹽 (sulcofuron-sodium)、硫醯氟、硫丙磷、焦油、噠蟎威、TDE、丁基嘧啶磷、雙硫磷、環戊烯丙菊酯、四氯乙烷、噠氯磷、殺蟲環、殺蟲環草酸鹽、蟲線磷、殺蟲單、殺蟲單鈉、四溴菊酯、反氯菊酯、啞蚜威、異皮蠅磷-3 (trichlormetaphos-3)、毒壤磷、混殺威、三氟甲氧威 (tolprocarb)、氯啶菌酯、烯蟲硫酯、藜蘆定、藜蘆鹼、XMC、ζ-氯氰菊酯 (zetamethrin)、磷化鋅、啞蟲磷、以及氯氟醚菊酯、四氟醚菊酯、雙(三丁基錫)氧化物、溴乙醯胺、磷酸鐵、氯硝柳胺-乙醇胺、三丁基氧化錫、吡啉、蝸螺殺、1,2-二溴-3-氯丙烷、1,3-二氯丙烯、3,4-二氯四氫噻吩1,1-二氧化物、3-(4-氯苯基)-5-甲基玫瑰寧、5-甲基-6-硫酮基-1,3,5-噠二吡-3-基乙酸、6-異戊烯基胺基嘌呤、2-氟-N-(3-甲氧基苯基)-9H-嘌呤-6-胺、苯氯噠、細胞分裂素、DCIP、糠醛、異醯胺磷、激動素、疣孢漆斑菌組成物、四氯噻吩、二甲苯酚、玉米素、乙基黃原酸鉀、阿拉酸式苯、阿拉酸式苯-S-甲基、大虎杖萃取物、α-氯代醇、安妥、碳酸鋇、雙鼠脛、溴鼠隆、溴敵



隆、溴鼠胺、氯鼠酮、膽鈣化醇、氯殺鼠靈、克滅鼠、殺鼠萘、殺鼠啞啉、鼠得克、噻鼠靈、敵鼠、鈣化醇、氟鼠靈、氟乙醯胺、氟鼠啉、氟鼠啉鹽酸鹽、鼠特靈、毒鼠磷、磷、殺鼠酮、滅鼠優、海蔥糖苷、氟乙酸鈉、硫酸鉈、殺鼠靈、2-(2-丁氧基乙氧基)乙基胡椒酸酯、5-(1,3-苯并二氧雜環戊烯-5-基)-3-己基環己-2-烯酮、具有橙花三級醇的茵綠烯醇、增效炔醚、MGK 264、胡椒基丁醚、增效醛、丙基異構物、S421、增效散、芝麻林素、亞砒、蔥醌、環烷酸銅、王銅、二環戊二烯、塞侖、環烷酸鋅、福美鋅、衣馬寧、利巴韋林、氯吡啶醯肼、氧化汞、甲基托布津、阿紮康唑、聯苯三唑醇、糠菌唑、環唑醇、苯醚甲環唑、烯唑醇、氟環唑、腈苯唑、氟啞唑、氟矽唑、粉唑醇、呋吡菌胺、己唑醇、抑黴唑、亞胺唑、種菌唑、葉菌唑、腈菌唑、多效唑、稻瘟酯、戊菌唑、丙硫菌唑、啞斑肼(pyriifenox)、咪鮮胺、丙環唑、啞菌唑、矽氟唑(simeconazole)、戊唑醇、氟醚唑、三唑酮、三唑醇、氟菌唑、滅菌唑、啞啞醇、氯苯啞啞醇、氟苯啞啞醇、乙啞啞磺酸酯(bupirimate)、甲菌定(dimethirimol)、乙菌定(ethirimol)、十二環啞、苯鏽啞、丁苯啞、螺環菌胺、十三啞、啞菌環胺、啞菌胺、啞黴胺(pyrimethanil)、拌種咯、咯菌腈、苯霜靈(benalaxyl)、呋霜靈(furalaxyl)、甲霜靈、R-甲霜靈、呋醯胺、惡霜靈(oxadixyl)、多菌靈、咪菌威(debacarb)、麥穗寧、噻苯達唑、乙菌利(chlozolate)、菌核利(dichlozoline)、甲菌利(myclozoline)、腐黴利(procymidone)、乙烯菌核利(vinclozoline)、啞醯菌胺(boscalid)、萎鏽靈、甲呋醯胺、氟醯胺(flutolanil)、滅鏽胺、氧化萎鏽靈、吡噻菌胺(penthiopyrad)、噻呋醯胺、多果定、雙胍辛胺、啞菌酯、醚菌胺、烯肼菌酯(enestroburin)、烯肼菌胺、氟菌蟻酯、氟啞菌酯、醚菌酯、苯氧菌胺、肼菌酯、肼醚菌胺、啞氧菌酯、唑菌胺酯、唑胺菌酯、唑菌酯、福美鐵、代森錳鋅、代森錳、代森聯、甲基代森鋅、代森鋅、敵菌丹、克菌丹、唑呋草、滅菌丹、對甲抑菌靈、波爾多混合劑、氧化銅、代森錳銅、啞啞銅、啞菌酯、克瘟散、異稻瘟淨、氯瘟磷、甲基立

枯磷、敵菌靈、苯噻菌胺、滅瘟素 (blasticidin)、地茂散 (chloroneb)、百菌清、環氟菌胺、霜脲氰、三氟吡啶胺 (cyclobutrifluram)、雙氯氰菌胺 (diclocymet)、噻菌酮 (diclomezine)、氯硝胺 (dicloran)、乙黴威 (diethofencarb)、烯醯啉、氟啉、二噻農 (dithianon)、噻唑菌胺 (ethaboxam)、土菌靈 (etridiazole)、惡唑菌酮、咪唑菌酮 (fenamidone)、稻瘟醯胺 (fenoxanil)、嘧菌腓 (ferimzone)、氟啶胺 (fluazinam)、嘧啶類殺菌劑 (flumetylsulforim)、氟吡菌胺 (fluopicolide)、氟康唑、磺菌胺 (flusulfamide)、氟唑菌醯胺、環醯菌胺、三乙膦酸鋁 (fosetyl-aluminium)、惡黴靈 (hymexazol)、丙森鋅、賽座滅 (cyazofamid)、磺菌威 (methasulfocarb)、苯菌酮、戊菌隆 (pencycuron)、苯酞、多氧黴素 (polyoxins)、霜黴威 (propamocarb)、吡菌苯威、碘喹唑酮 (proquinazid)、咯喹酮 (pyroquilon)、苯啶菌酮 (pyriofenone)、喹氧靈、五氯硝基苯、噻醯菌胺、咪唑吡 (triazoxide)、三環唑、吡啶靈、有效黴素、顯菌胺、苯醯菌胺 (zoxamide)、雙炔醯菌胺 (mandipropamid)、氟苯醚醯胺 (flubeneteram)、吡啶萘菌胺 (isopyrazam)、氟唑環菌胺 (sedaxane)、苯并烯氟菌唑、氟唑菌醯脛胺、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酸(3',4',5'-三氟-聯苯-2-基)-醯胺、吡啶甲醯胺類殺菌劑 (isoflucypram)、異噻菌胺、敵派美創 (dipymetitrone)、6-乙基-5,7-二側氧基-吡咯并[4,5][1,4]二噻英并[1,2-c]異噻唑-3-甲脞、2-(二氟甲基)-N-[3-乙基-1,1-二甲基-二氫茚-4-基]吡啶-3-甲醯胺、4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基-嗒吡-3-甲脞、(R)-3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[1,1,3-三甲基二氫茚-4-基]吡啶-4-甲醯胺、4-(2-溴-4-氟-苯基)-N-(2-氯-6-氟-苯基)-2,5-二甲基-吡啶-3-胺、4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡啶-5-胺、氟茚唑菌胺 (fluindapyr)、甲香菌酯 (jiaxiangjunzhi)、氯苯醚醯胺、二氯苯并噻唑、曼德斯賓 (mandestrobin)、3-(4,4-二氟-3,4-二氫-3,3-二甲基異喹啉-1-基)喹啉酮、2-[2-氟-6-[(8-氟-2-甲基-3-喹啉基)氧基]苯基]丙-2-醇、噻吡菌靈 (oxathiapiprolin)、N-[6-[[[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亞甲基]胺基]氧基甲基]-

2-吡啶基]胺基甲酸三級丁酯、聯苯吡菌胺、琥珀酸脫氫酶抑制劑類殺菌劑、胺基甲酸酯類殺菌劑、氯氟醚菌唑、伊芬三氟康唑、2-(二氟甲基)-N-[(3R)-3-乙基-1,1-二甲基-二氫茛-4-基]吡啶-3-甲醯胺、N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒、N'-[4-(4,5-二氯噻唑-2-基)氧基-2,5-二甲基-苯基]-N-乙基-N-甲基-甲脒、[2-[3-[2-[1-[2-[3,5-雙(二氟甲基)吡唑-1-基]乙醯基]-4-哌啶基]噻唑-4-基]-4,5-二氫異噁唑-5-基]-3-氯-苯基]甲磺酸酯、N-[6-[(Z)-[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亞甲基]胺基]氧基甲基]-2-吡啶基]胺基甲酸丁-3-炔酯、N-[[5-[4-(2,4-二甲基苯基)三唑-2-基]-2-甲基-苯基]甲基]胺基甲酸甲酯、3-氯-6-甲基-5-苯基-4-(2,4,6-三氟苯基)嗒、苯基嗒類殺菌劑、3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[1,1,3-三甲基二氫茛-4-基]吡唑-4-甲醯胺、1-[2-[[1-(4-氯苯基)吡唑-3-基]氧基甲基]-3-甲基-苯基]-4-甲基-四唑-5-酮、1-甲基-4-[3-甲基-2-[[2-甲基-4-(3,4,5-三甲基吡唑-1-基)苯氧基]甲基]苯基]四唑-5-酮、胺基吡吩、唑啉菌胺、吡啶菌胺、氟唑菌苯胺、(Z,2E)-5-[1-(4-氯苯基)吡唑-3-基]氧基-2-甲氧基亞胺基-N,3-二甲基-戊-3-烯胺、吡啶菌醯胺、苯吡克咪德 (fenpicoxamid)、甲基吡蟲胺、異丁乙氧喹啉、喹啉類殺菌劑、喹啉菲莫啉、異丙噻菌胺、1-[[4-[[2-(三氟甲基)-1,3-二氧戊環-2-基]甲氧基]苯基]甲基]吡唑-3-甲酸乙酯 (可以由WO 2020/056090中描述之方法製備)、1-[[4-[(Z)-2-乙氧基-3,3,3-三氟-丙-1-烯氧基]苯基]甲基]吡唑-3-甲酸乙酯(可以由WO 2020/056090中描述之方法製備)、N-[[4-[1-(4-環丙基-2,6-二氟-苯基)吡唑-4-基]-2-甲基-苯基]甲基]胺基甲酸甲酯 (可以由WO 2020/097012中描述之方法製備)、N-[[4-[1-(2,6-二氟-4-異丙基-苯基)吡唑-4-基]-2-甲基-苯基]甲基]胺基甲酸甲酯 (可以由WO 2020/097012中描述之方法製備)、6-氯-3-(3-環丙基-2-氟-苯氧基)-N-[2-(2,4-二甲基苯基)-2,2-二氟-乙基]-5-甲基-嗒吡-4-甲醯胺 (可以由WO 2020/109391中描述之方法製備)、6-氯-N-[2-(2-氯-4-甲基-苯基)-2,2-二氟-乙基]-3-(3-環丙基-2-氟-苯氧基)-5-甲基-嗒吡-4-甲醯胺 (可以由WO 2020/109391中描述之方法製備)、6-氯-3-(3-環丙基-

2-氟-苯氧基)-N-[2-(3,4-二甲基苯基)-2,2-二氟-乙基]-5-甲基-吡啶-4-甲醯胺(可以由WO 2020/109391中描述之方法製備)、N-[2-[2,4-二氟-苯氧基]苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-吡啶-4-甲醯胺、N-[2-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-吡啶-4-甲醯胺、苯噻菌酯、氟烯菌酯、5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇鋅鹽(2:1)、氟吡菌醯胺、氟蟲胺嘧啶(flufenoxadiazam)、氟噻唑菌脞、氟醚菌醯胺、吡啶甲醯胺類殺菌劑(pyrapropoyne)、哌碳唑(picarbutrazox)、2-(二氟甲基)-N-(3-乙基-1,1-二甲基-二氫茛-4-基)吡啶-3-甲醯胺、2-(二氟甲基)-N-((3R)-1,1,3-三甲基二氫茛-4-基)吡啶-3-甲醯胺、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲脞、四唑菌酮、2-(二氟甲基)-N-((3R)-1,1,3-三甲基二氫茛-4-基)吡啶-3-甲醯胺、 $\alpha$ -(1,1-二甲基乙基)- $\alpha$ -[4'-(三氟甲氧基)[1,1'-二苯基]-4-基]-5-嘧啶甲醇、哌啶基噻唑異噁唑啉類殺菌劑(fluxapiprolin)、烯肱菌酯(enoxastrobin)、(Z)-3-甲氧基-2-[2-甲基-5-[4-(三氟甲基)三唑-2-基]苯氧基]丙-2-烯酸甲酯、(Z)-3-甲氧基-2-[2-甲基-5-(4-丙基三唑-2-基)苯氧基]丙-2-烯酸甲酯、(Z)-2-[5-(3-異丙基吡啶-1-基)-2-甲基-苯氧基]-3-甲氧基-丙-2-烯酸甲酯、(Z)-3-甲氧基-2-[2-甲基-5-(3-丙基吡啶-1-基)苯氧基]丙-2-烯酸甲酯、(Z)-3-甲氧基-2-[2-甲基-5-[3-(三氟甲基)吡啶-1-基]苯氧基]丙-2-烯酸甲酯(該等化合物可以由WO 2020/079111中描述之方法製備)、(Z)-2-(5-環己基-2-甲基-苯氧基)-3-甲氧基-丙-2-烯酸甲酯、(Z)-2-(5-環戊基-2-甲基-苯氧基)-3-甲氧基-丙-2-烯酸甲酯(該等化合物可以由WO 2020/193387中描述之方法製備)、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲脞、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(5-氫硫基-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲脞、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(5-硫酮基-4H-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲脞、抗倒酯、丁香菌酯、中生菌素、噻菌銅、噻唑鋅、阿米替林(amectotractin)、異菌脲、辛菌胺、N'-[5-溴-2-甲基-6-[(1S)-1-甲基-2-丙氧基-乙

氧基]-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒、N'-[5-溴-2-甲基-6-[(1R)-1-甲基-2-丙氧基-乙氧基]-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒、N'-[5-溴-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒、N'-[5-氯-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒、N'-[5-溴-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-異丙基-N-甲基-甲脒（該等化合物可以由WO 2015/155075中描述之方法製備）；N'-[5-溴-2-甲基-6-(2-丙氧基丙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒（此化合物可以由IPCOM000249876D中描述之方法製備）；N-異丙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-(2,2,2-三氟-1-羥基-1-苯基-乙基)苯基]-N-甲基-甲脒、N'-[4-(1-環丙基-2,2,2-三氟-1-羥基-乙基)-5-甲氧基-2-甲基-苯基]-N-異丙基-N-甲基-甲脒（該等化合物可以由WO 2018/228896中描述之方法製備）；N-乙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-[(2-三氟甲基)氧雜環丁烷-2-基]苯基]-N-甲基-甲脒、N-乙基-N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-[(2-三氟甲基)四氫呋喃-2-基]苯基]-N-甲基-甲脒（該等化合物可以由WO 2019/110427中描述之方法製備）；N-[(1R)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺、N-[(1S)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺、N-[(1R)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺、N-[(1S)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺、N-[(1R)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺、N-[(1S)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺、8-氟-N-[(1R)-1-[(3-氟苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲醯胺、8-氟-N-[(1S)-1-[(3-氟苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲醯胺、N-[(1R)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺、N-[(1S)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺、N-[(1R)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺、N-[(1S)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺（該等化合物可以由WO 2017/153380中描述之方法製備）；1-(6,7-二甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4,5-三氟-3,3-二甲基-異喹啉、1-(6,7-二甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4,6-三氟-3,3-二甲基-異喹啉、4,4-

二氟-3,3-二甲基-1-(6-甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)異喹啉、4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(7-甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)異喹啉、1-(6-氯-7-甲基-吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-異喹啉(該等化合物可以由WO 2017/025510中描述之方法製備); 1-(4,5-二甲基苯并咪唑-1-基)-4,4,5-三氟-3,3-二甲基-異喹啉、1-(4,5-二甲基苯并咪唑-1-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-異喹啉、6-氯-4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(4-甲基苯并咪唑-1-基)異喹啉、4,4-二氟-1-(5-氟-4-甲基-苯并咪唑-1-基)-3,3-二甲基-異喹啉、3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-1-異喹啉基)-7,8-二氫-6H-環戊二烯并[e]苯并咪唑(該等化合物可以由WO 2016/156085中描述之方法製備); N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]環丙烷甲醯胺、N,2-二甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙醯胺、N-乙基-2-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙醯胺、1-甲氧基-3-甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲、1,3-二甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲、3-乙基-1-甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲、N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙醯胺、4,4-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]異噁唑啉-3-酮、5,5-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]異噁唑啉-3-酮、1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡啶-4-甲酸乙酯、N,N-二甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-1,2,4-三唑-3-胺(該等化合物可以由WO 2017/055473、WO 2017/055469、WO 2017/093348和WO 2017/118689中描述之方法製備); 2-[6-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇(此化合物可以由WO 2017/029179中描述之方法製備); 2-[6-(4-溴苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇(此化合物可以由WO 2017/029179中描述之方法製備); 3-[2-(1-氯環丙基)-3-(2-氟苯基)-2-羥基-丙基]咪唑-4-甲腈(此化合物可以由WO 2016/156290中描述之方法製備); 3-[2-(1-氯環丙基)-3-(3-

氯-2-氟-苯基)-2-羥基-丙基]咪唑-4-甲腈（此化合物可以由WO 2016/156290中描述之方法製備）；2-胺基-6-甲基-吡啶-3-甲酸(4-苯氧基苯基)甲酯（此化合物可以由WO 2014/006945中描述之方法製備）；2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二噻英并[2,3-c:5,6-c']二吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮（此化合物可以由WO 2011/138281中描述之方法製備）、N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]硫代苯甲醯胺；N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺；(Z,2E)-5-[1-(2,4-二氯苯基)吡唑-3-基]氧基-2-甲氧基亞胺基-N,3-二甲基-戊-3-烯胺（此化合物可以由WO 2018/153707中描述之方法製備）；N'-(2-氯-5-甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒；N'-[2-氯-4-(2-氟苯氧基)-5-甲基-苯基]-N-乙基-N-甲基-甲脒（此化合物可以由WO 2016/202742中描述之方法製備）；2-(二氟甲基)-N-[(3S)-3-乙基-1,1-二甲基-二氫茛-4-基]吡啶-3-甲醯胺（此化合物可以由WO 2014/095675中描述之方法製備）；(5-甲基-2-吡啶基)-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲酮、(3-甲基異噁唑-5-基)-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲酮（該等化合物可以由WO 2017/220485中描述之方法製備）；2-側氧基-N-丙基-2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙醯胺（此化合物可以由WO 2018/065414中描述之方法製備）；1-[[5-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]-2-噻吩基]甲基]吡唑-4-甲酸乙酯（此化合物可以由WO 2018/158365中描述之方法製備）；2,2-二氟-N-甲基-2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙醯胺、N-[(E)-甲氧基亞胺基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺、N-[(Z)-甲氧基亞胺基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺、N-[N-甲氧基-甲基-碳醯亞胺基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺（該等化合物可以由WO 2018/202428中描述之方法製備）。

**【0210】** 本發明之化合物也可以與驅蠕蟲藥劑組合使用。此類驅蠕蟲藥劑包括選自大環內酯類化合物的化合物，如伊維菌素、阿維菌素、阿巴美丁、艾瑪菌素、依立諾克丁、朵拉克汀、司拉克丁、莫昔克丁、奈馬克丁以及米爾倍黴素

衍生物，如在EP 0357460、EP 0444964和EP 0594291中所述。另外的驅蠕蟲藥劑包括半合成及生物合成阿維菌素/米爾倍黴素衍生物，如在US 5,015,630、WO 94/15944和WO 95/22552中所述之那些。另外的驅蠕蟲藥劑包括苯并咪唑類，如阿苯達唑、坎苯達唑、芬苯達唑、氟苯達唑、甲苯達唑、奧芬達唑、奧苯達唑、帕苯達唑以及該類別的其他成員。另外的驅蠕蟲藥劑包括咪唑并噻唑類以及四氫嘧啶類，如四咪唑、左旋咪唑、雙羥萘酸噻嘧啶、奧克太爾或莫侖太爾。另外的驅蠕蟲藥劑包括殺吸蟲劑（如三氯苯達唑和氯舒隆）以及殺條蟲劑（如吡喹酮和依西太爾）。

**【0211】** 本發明之化合物可以與對郝青醯胺（paraherquamide）/馬可氟汀（marcfortine）類驅蠕蟲藥劑的衍生物及類似物以及抗寄生蟲啞唑啉（如在US 5,478,855、US 4,639,771和DE-19520936中所揭露的那些）組合使用。

**【0212】** 本發明之化合物可以與如WO 96/15121中所述之一般種類二氧咪啉抗寄生蟲劑的衍生物和類似物以及還與驅蠕蟲活性的環狀酯肽（如WO 96/11945、WO 93/19053、WO 93/25543、EP 0626375、EP 0382173、WO 94/19334、EP 0382173、以及EP 0503538所述之那些）組合使用。

**【0213】** 本發明之化合物可以與其他殺外寄生蟲藥組合使用；例如，氟蟲脞；擬除蟲菊酯；有機磷酸酯；昆蟲生長調節劑如氯芬奴隆；蛻皮激素促效劑如蟲醯肼等；新菸鹼類如吡蟲啉等。

**【0214】** 本發明之化合物可以與萜烯生物鹼類組合使用，例如WO 95/19363或WO 04/72086中所述之那些，特別是其中所揭露的化合物。

**【0215】** 可以與本發明之化合物組合使用的此類生物活性化合物的其他實例包括但不限於以下：

**【0216】** 有機磷酸酯：乙醯甲胺磷、甲基吡啶磷、乙基穀硫磷、甲基穀硫磷、溴硫磷、乙基溴硫磷、硫線磷、四氯乙磷（chlorethoxyphos）、毒死蜱、氯芬



磷、氯甲磷、內吸磷、內吸磷-S-甲基、內吸磷-S-甲基氫、氯亞胺硫磷、二吡磷、敵敵畏、百治磷、樂果、乙拌磷、乙硫磷、滅線磷、氧嘧啶磷、伐滅磷、苯線磷、殺螟硫磷、豐索磷、倍硫磷、吡氟硫磷、地蟲磷、安果、噻唑磷、庚烯磷、氯唑磷、異丙磷、異噁唑磷、馬拉硫磷、蟲蟊畏、甲胺磷、殺撲磷、甲基對硫磷、速滅磷、久效磷、二溴磷、氧樂果、甲基側氧基內吸磷、對氧磷、對硫磷、甲基對硫磷、稻豐散、伏殺硫磷、硫環磷、磷克、亞胺硫磷、磷胺、甲拌磷、肱硫磷、蟲蟊磷、蟲蟊磷-甲基、丙溴磷、丙蟲磷、丙泰磷 (proetamphos)、丙硫磷、吡唑硫磷、嗒硫磷、喹硫磷、硫滅克磷、替美磷、特丁磷、丁基嘧啶磷、司替羅磷、二甲硫吸磷 (thimeton)、三唑磷、敵百蟲、滅蚜硫磷。

【0217】 胺基甲酸酯：棉鈴威、涕滅威、2-二級丁苯基甲基胺基甲酸酯、丙硫克百威、甲萘威、克百威、丁硫克百威、地蟲威、乙硫苯威、苯氧威、芬硫克、呋線威、HCN-801、異丙威、節蟲威、滅蟲威、滅多蟲、5-甲基-間-異丙苯基丁炔基(甲基)胺基甲酸酯、殺線威、抗蚜威、殘殺威、硫雙威、久效威、啞蚜威、UC-51717。

【0218】 擬除蟲菊酯：氟丙菊酯、丙烯除蟲菊酯、順式氯氰菊酯 (alphamethrin)、5-苄基-3-呋喃基甲基(E)-(1R)-順式-2,2-二甲基-3-(2-氧硫雜環戊-3-亞基甲基)環丙烷甲酸酯、聯苯菊酯、β-氟氯氰菊酯、氟氯氰菊酯、順式氯氰菊酯 (α-cypermethrin)、β-氯氰菊酯、生物烯丙菊酯、生物烯丙菊酯 ((S)-環戊基異構物)、生物苄呋菊酯、聯苯菊酯、NCI-85193、擬除蟲菊酯、三氟氯氰菊酯、氯氰菊酯 (cythithrin)、苯氰菊酯、溴氰菊酯、右旋烯炔菊酯、高氰戊菊酯、醚菊酯、五氟苯菊酯、甲氰菊酯、氰戊菊酯、氟氰戊菊酯、氟氯苯菊酯、氟胺氰菊酯 (D異構物)、炔咪菊酯、三氟氯氰菊酯、λ-三氟氯氰菊酯、苄氯菊酯、苯醚菊酯、炔丙菊酯、除蟲菊酯 (天然產物)、苄呋菊酯、胺菊酯、四氟苯菊酯、θ-氯氰菊酯、氟矽菊酯、t-氟胺氰菊酯、七氟菊酯、四溴菊酯、ζ-氯氰菊酯。

【0219】 節肢動物生長調節劑：a) 甲殼質合成抑制劑：苯甲醯脲：定蟲隆、除蟲脲、啶蟬脲、氟蟬脲、氟蟲脲、氟鈴脲、氯芬奴隆、雙苯氟脲、伏蟲脲、殺蟲脲、噻酮、苯蟲醚、噻蟎酮、乙蟎唑、四蟎吡 (chlorfentazine)；b) 蛻皮激素拮抗劑：氯蟲醯肼、甲氧蟲醯肼、蟲醯肼；c) 保幼激素類似物：吡丙醚、烯蟲酯 (包括S-烯蟲酯)、苯氧威；d) 脂質生物合成抑制劑：螺蟎酯。

【0220】 其他抗寄生蟲藥：滅蟎醌、雙甲脒、AKD-1022、ANS-118、印棟素、蘇雲金桿菌、殺蟲磺、聯苯肼酯、樂殺蟎、溴蟎酯、BTG-504、BTG-505、毒殺芬、殺螟丹、乙酯殺蟎醇、殺蟲脒、溴蟲腈、環蟲醯肼、噻蟲胺、賽滅淨、敵克隆登 (diaclofen)、殺蟎隆、DBI-3204、二活菌素、二羥基甲基二羥基吡咯啉、敵蟎通、敵蟎普、硫丹、乙蟲腈、醚菊酯、啞蟎醚、氟蟎吡 (flumite)、MTI-800、啞蟎酯、啞蟎酯、氟蟎噻、溴氟菊酯、氟蟎吡、三氟醚、苄蟎醚 (fluproxyfen)、苄蟎醚 (halofenprox)、氟蟎脒、IKI-220、水矽鈉石、NC-196、印度薄荷草 (neem guard)、尼敵諾特呋喃 (nidinorterfuran)、烯啶蟲胺、SD-35651、WL-108477、啞蟲丙醚、克蟎特、普羅芬布特 (protrifenbute)、吡蚜酮、啞蟎酮、啞蟎醚、NC-1111、R-195、RH-0345、RH-2485、RYI-210、S-1283、S-1833、SI-8601、氟矽菊酯、矽羅瑪汀 (silomadine)、多殺菌素、吡蟎胺、三氯殺蟎磺、四抗菌素、噻蟲啉、殺蟲環、噻蟲吡、啞蟲醯胺、啞蚜威、三乙多殺菌素、三活菌素、增效炔醚、波塔雷克 (vertalec)、YI-5301。

【0221】 生物劑：蘇雲金芽孢桿菌亞莎華亞種 (*Bacillus thuringiensis* ssp. *aizawai*)、蘇雲金芽孢桿菌庫斯塔克亞種 (*kurstaki*)、蘇雲金芽孢桿菌 $\delta$ 內毒素、桿狀病毒、昆蟲病原細菌、病毒以及真菌。

【0222】 殺細菌劑：金黴素、土黴素、鏈黴素。

【0223】 其他生物劑：恩氟沙星、非班太爾、噴沙西林、美洛昔康、頭孢胺苄、康黴素、匹莫苯、克侖特羅、奧美拉唑、硫姆林、貝那普利、皮瑞普

(pyriprole)、頭孢喹肟、氟苯尼考、布舍瑞林、頭孢維星、托拉菌素、頭孢噻唑、卡洛芬、美氟脞、吡嗪酮、三氯苯達唑。

【0224】 具有式 (I) 的化合物與活性成分的以下混合物係較佳的。縮寫「TX」意指選自由具有式 (I)、(Ia)、(Ia-A)、(Ia-B) 或 (Ia-C) 的化合物組成之群組的一種化合物，或選自由如表C-1至C-21中所示的化合物組成之群組的一種化合物，或如(下)表P中列出的化合物：

選自由以下組成的物質組的化合物：石油油料 + TX、1,1-雙(4-氯苯基)-2-乙氧基乙醇 + TX、2,4-二氯苯基苯磺酸酯 + TX、2-氟-N-甲基-N-1-萘乙醯胺 + TX、4-氯苯基苯基砒 + TX、乙醯蟲脞 + TX、涕滅砒威 + TX、賽果 + TX、果滿磷 + TX、胺吸磷 + TX、草酸氫胺吸磷 + TX、雙甲脞 + TX、殺蟎特 + TX、三氧化二砷 + TX、偶氮苯 + TX、偶氮磷 + TX、苯菌靈 + TX、苯諾沙磷 (benoxafos) + TX、苯甲酸苄酯 + TX、聯苯吡菌胺 + TX、溴滅菊酯 + TX、溴烯殺 + TX、溴硫磷 + TX、溴蟎酯 + TX、噻酮 + TX、丁酮威 + TX、丁酮砒威 + TX、丁基噻蟎靈 + TX、多硫化鈣 + TX、八氯蒽烯 + TX、氯滅殺威 + TX、三硫磷 + TX、蟎蟀胺 + TX、滅蟎猛 + TX、氯殺蟎 + TX、殺蟲脞 + TX、殺蟲脞鹽酸鹽 + TX、殺蟎醇 + TX、殺蟎酯 + TX、敵蟎特 + TX、乙酯殺蟎醇 + TX、滅蟎脞 (chloromebuform) + TX、滅蟲脞 + TX、丙酯殺蟎醇 + TX、蟲蟎磷 + TX、瓜菊酯I + TX、瓜菊酯II + TX、瓜菊酯 + TX、克羅散泰 + TX、蠅毒磷 + TX、克羅米通 + TX、巴毒磷 + TX、硫雜靈 + TX、果蟲磷 + TX、DCPM + TX、DDT + TX、田樂磷 + TX、田樂磷-O + TX、田樂磷-S + TX、內吸磷-甲基 + TX、內吸磷-O + TX、內吸磷-O-甲基 + TX、內吸磷-S + TX、內吸磷-S-甲基 + TX、內吸磷-S-甲基砒 + TX、抑菌靈 + TX、敵敵畏 + TX、二克磷 (dicliphos) + TX、除蟎靈 + TX、甲氟磷 + TX、消蟎酚 (dinex) + TX、消蟎酚 (dinex-diclexine) + TX、敵蟎普-4 + TX、敵蟎普-6 + TX、鄰敵蟎消 + TX、硝戊酯 + TX、硝辛酯

+ TX、硝丁酯 + TX、敵殺磷 + TX、磺基二苯 + TX、戒酒硫 + TX、DNOC + TX、苯氧炔蟎 (dofenapyn) + TX、朵拉克汀 + TX、因毒磷 + TX、依立諾克丁 + TX、益硫磷 + TX、乙嘧硫磷 + TX、抗蟎唑 + TX、苯丁錫 + TX、苯硫威 + TX、吡蟎胺 + TX、唑蟎酯 + TX、胺苯吡菌酮 + TX、除蟎酯 + TX、氟硝二苯胺 (fentrifanil) + TX、氟蟎噻 + TX、氟蟎脲 + TX、聯氟蟎 + TX、氟殺蟎 + TX、FMC 1137 + TX、伐蟲脛 + TX、伐蟲脛鹽酸鹽 + TX、胺甲威 (formparanate) + TX、 $\gamma$ -HCH + TX、果綠定 + TX、苜蟎醚 + TX、十六烷基環丙烷羧酸酯 + TX、水胺硫磷 + TX、茉莉菊酯I + TX、茉莉菊酯II + TX、碘硫磷 + TX、林丹 + TX、丙蟎氰 + TX、滅蚜磷 + TX、二噻磷 + TX、甲硫芬 + TX、蟲蟎畏 + TX、溴甲烷 + TX、速滅威 + TX、自克威 + TX、米爾貝脞 + TX、丙胺氟 + TX、久效磷 + TX、茂果 + TX、莫昔克丁 + TX、二溴磷 (naled) + TX、4-氯-2-(2-氯-2-甲基-丙基)-5-[(6-碘-3-吡啶基)甲氧基]嗒吡-3-酮 + TX、氟蟎靈 + TX、尼可黴素 + TX、戊氰威 + TX、戊氰威1:1氯化鋅錯合物 + TX、氧樂果 + TX、亞異砒磷 + TX、砒拌磷 + TX、pp'-DDT + TX、對硫磷 + TX、苜氯菊酯 + TX、芬硫磷 + TX、伏殺磷 + TX、硫環磷 + TX、磷胺 + TX、氯化松節油 (polychloroterpenes) + TX、殺蟎素 (polynactins) + TX、丙氯諾 + TX、蜚虱威 + TX、殘殺威 + TX、乙噻唑磷 + TX、發硫磷 + TX、除蟲菊酯I + TX、除蟲菊酯II + TX、除蟲菊酯 + TX、嗒硫磷 + TX、嘧硫磷 + TX、喹硫磷 (quinalphos) + TX、喹硫磷 (quintiofos) + TX、R-1492 + TX、甘胺硫磷 + TX、魚藤酮 + TX、八甲磷 + TX、克線丹 + TX、司拉克丁 + TX、蘇硫磷 + TX、SSI-121 + TX、舒非侖 + TX、氟蟲胺 + TX、硫特普 + TX、硫 + TX、氟蟎吡 + TX、 $\tau$ -氟胺氰菊酯 + TX、TEPP + TX、叔丁威 + TX、四氯殺蟎砒 + TX、殺蟎好 + TX、噻吩諾 + TX、抗蟲威 + TX、久效威 + TX、甲基乙拌磷 + TX、克殺蟎 + TX、蘇力菌素 + TX、威菌磷 + TX、苯蟎噻 + TX、三唑磷 + TX、滅蚜唑 (triazuron) + TX、三氯丙氧磷 + TX、三

活菌素 + TX、蚜滅多 + TX、甲烯氟蟲腈(vaniliprole) + TX、百殺辛(bethoxazin) + TX、二辛酸銅 + TX、硫酸銅 + TX、環丁腈 + TX、二氯萘醌 + TX、雙氯酚 + TX、菌多酸 + TX、三苯錫 + TX、熟石灰 + TX、代森鈉 + TX、滅藻醌 + TX、醌苜胺 + TX、西瑪津 + TX、三苯基乙酸錫 + TX、三苯基氫氧化錫 + TX、育畜磷 + TX、哌 + TX、托布津 + TX、氯醛糖 + TX、倍硫磷 + TX、吡啶-4-胺 + TX、土的寧 + TX、1-羥基-1H-吡啶-2-硫酮 + TX、4-(喹啉-2-基胺基)苯磺醯胺 + TX、8-羥基喹啉硫酸鹽 + TX、溴硝醇 + TX、氫氧化銅 + TX、甲酚 + TX、雙吡硫翁 + TX、多地辛 + TX、敵磺鈉 + TX、甲醛 + TX、汞加芬 + TX、春雷黴素 + TX、春雷黴素鹽酸鹽水合物 + TX、二(二甲基二硫代胺基甲酸)鎳 + TX、三氯甲基吡啶 + TX、辛噻酮 + TX、奧索利酸 + TX、土黴素 + TX、羥基喹啉硫酸鉀 + TX、噻菌靈 + TX、鏈黴素 + TX、鏈黴素倍半硫酸鹽 + TX、葉枯酞 + TX、硫柳汞 + TX、棉褐帶卷蛾GV + TX、放射形土壤桿菌 + TX、鈍綏蟎屬物種 + TX、芹菜夜蛾NPV + TX、原櫻翅繭小蜂 + TX、短距蚜小蜂 + TX、棉蚜寄生蜂 + TX、食蚜瘿蚊 + TX、苜蓿銀紋夜蛾NPV + TX、球形芽孢桿菌 + TX、布氏白僵菌 + TX、普通草蛉 + TX、孟氏隱唇瓢蟲 + TX、蘋果蠹蛾GV + TX、西伯利亞離顎繭蜂 + TX、豌豆潛葉蠅姬小蜂 + TX、麗蚜小蜂 + TX、槲角蚜小蜂 + TX、嗜菌異小桿線蟲和大異小桿線蟲 + TX、斑長足瓢蟲 + TX、橘粉介殼蟲寄生蜂 + TX、盲蝽 + TX、甘藍夜蛾NPV + TX、黃闊柄跳小蜂 + TX、黃綠綠僵菌 + TX、金龜子綠僵菌小孢變種 + TX、歐洲新松葉蜂NPV和紅頭新松葉蜂NPV + TX、小花蝽屬物種 + TX、玫煙色擬青黴 + TX、智利小植綏蟎 + TX、毛蚊線蟲 + TX、小卷蛾斯氏線蟲 + TX、夜蛾斯氏線蟲 + TX、格氏線蟲 + TX、銳比斯氏線蟲 + TX、裡氏斯氏線蟲(Steinernema riobravis) + TX、螻蛄斯氏線蟲 + TX、斯氏線蟲屬物種 + TX、赤眼蜂屬物種 + TX、西方盲走蟎 + TX、蠟蚧輪枝菌 + TX、唑磷吡 + TX、雙(氮丙啶)甲胺基磷硫化物 + TX、白消安 + TX、

迪麥替夫 + TX、六甲蜜胺 + TX、六甲磷 + TX、甲基涕巴 + TX、甲硫涕巴 + TX、  
 甲基唑磷啉 + TX、不孕啉 + TX、氟幼脲 + TX、涕巴 + TX、硫代六甲磷 + TX、  
 硫涕巴 + TX、曲他胺 + TX、尿烷亞胺 + TX、(E)-癸-5-烯-1-基乙酸酯與  
 (E)-癸-5-烯-1-醇 + TX、(E)-十三碳-4-烯-1-基乙酸酯 + TX、(E)-6-甲基庚-2-烯-4-  
 醇 + TX、(E,Z)-十四碳-4,10-二烯-1-基乙酸酯 + TX、(Z)-十二碳-7-烯-1-基乙酸  
 酯 + TX、(Z)-十六碳-11-烯醛 + TX、(Z)-十六碳-11-烯-1-基乙酸酯 + TX、(Z)-  
 十六碳-13-烯-11-炔-1-基乙酸酯 + TX、(Z)-二十-13-烯-10-酮 + TX、(Z)-十四碳-  
 7-烯-1-醛 + TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-醇 + TX、(Z)-十四碳-9-烯-1-基乙酸酯 + TX、  
 (7E,9Z)-十二碳-7,9-二烯-1-基乙酸酯 + TX、(9Z,11E)-十四碳-9,11-二烯-1-基乙酸  
 酯 + TX、(9Z,12E)-十四碳-9,12-二烯-1-基乙酸酯 + TX、14-甲基十八碳-1-烯 +  
 TX、4-甲基壬-5-醇與4-甲基壬-5-酮 + TX、 $\alpha$ -多紋素 + TX、西部松小蠹集合資  
 訊素 + TX、十二碳二烯醇 + TX、可得蒙 + TX、誘蠅酮 + TX、環氧十九烷 +  
 TX、十二碳-8-烯-1-基乙酸酯 + TX、十二碳-9-烯-1-基乙酸酯 + TX、十二碳-8 +  
 TX、10-二烯-1-基乙酸酯 + TX、多明尼克魯爾 + TX、4-甲基辛酸乙酯 + TX、  
 丁香酚 + TX、南部松小蠹集合資訊素 + TX、誘殺烯混劑 + TX、誘殺烯混劑I  
 + TX、誘殺烯混劑II + TX、誘殺烯混劑III + TX、誘殺烯混劑IV + TX、己誘劑 +  
 TX、齒小蠹二烯醇 + TX、小蠹烯醇 + TX、金龜子性誘劑 + TX、三甲基二氧  
 三環壬烷 + TX、夜蛾誘劑 (lilture) + TX、粉紋夜蛾性誘劑 + TX、誘殺酯 +  
 TX、蒙托麼克酸 (megatomoic acid) + TX、誘蟲醚 + TX、誘蟲烯 + TX、十八  
 碳-2,13-二烯-1-基乙酸酯 + TX、十八碳-3,13-二烯-1-基乙酸酯 + TX、賀康彼 +  
 TX、椰蛀犀金龜聚集資訊素 + TX、非樂康 + TX、誘蟲環 + TX、索迪叮 (sordidin)  
 + TX、食菌甲誘醇 + TX、十四碳-11-烯-1-基乙酸酯 + TX、地中海實蠅引誘劑  
 + TX、地中海實蠅引誘劑A + TX、地中海實蠅引誘劑B1 + TX、地中海實蠅引誘  
 劑B2 + TX、地中海實蠅引誘劑C + TX、創特嶠 + TX、2-(辛基硫代)-乙醇 + TX、

避蚊酮 + TX、丁氧基(聚丙二醇) + TX、己二酸二丁酯 + TX、鄰苯二甲酸二丁酯 + TX、丁二酸二丁酯 + TX、避蚊胺 + TX、驅蚊靈 + TX、鄰苯二甲酸二甲酯 + TX、乙基己二醇 + TX、己脲 + TX、甲嗒丁 + TX、甲基新癸醯胺 + TX、草胺酸鹽 + TX、派卡瑞丁 + TX、1-二氯-1-硝基乙烷 + TX、1,1-二氯-2,2-二(4-乙基苯基)-乙烷 + TX、1,2-二氯丙烷與1,3-二氯丙烯 + TX、1-溴-2-氯乙烷 + TX、2,2,2-三氯-1-(3,4-二氯苯基)乙基乙酸酯 + TX、2,2-二氯乙基2-乙基亞磺醯基乙基甲基磷酸酯 + TX、2-(1,3-二硫戊環-2-基)苯基二甲基胺基甲酸酯 + TX、2-(2-丁氧基乙氧基)乙基硫氰酸酯 + TX、2-(4,5-二甲基-1,3-二氧戊環-2-基)苯基甲基胺基甲酸酯 + TX、2-(4-氯-3,5-二甲苯基氧基)乙醇 + TX、2-氯乙基二乙基磷酸酯 + TX、2-咪唑啉酮 + TX、2-異戊醯二氫茛-1,3-二酮 + TX、2-甲基(丙-2-炔基)胺基苯基甲基胺基甲酸酯 + TX、2-氰硫基乙基月桂酸酯 + TX、3-溴-1-氯丙-1-烯 + TX、3-甲基-1-苯基吡啶-5-基二甲基-胺基甲酸酯 + TX、4-甲基(丙-2-炔基)胺基-3,5-二甲苯基甲基胺基甲酸酯 + TX、5,5-二甲基-3-側氧基環己-1-烯基二甲基胺基甲酸酯 + TX、阿賽硫磷 + TX、丙烯腈 + TX、艾氏劑 + TX、阿洛胺菌素 + TX、除害威 + TX、 $\alpha$ -蛻皮激素 + TX、磷化鋁 + TX、滅害威 + TX、新菸鹼 + TX、乙基殺撲磷(athidathion) + TX、甲基吡啶磷 + TX、蘇雲金芽孢桿菌 $\delta$ -內毒素 + TX、六氟矽酸鋇 + TX、多硫化鋇 + TX、熏菊酯 + TX、拜耳22/190 + TX、拜耳22408 + TX、 $\beta$ -氟氯氰菊酯 + TX、 $\beta$ -氯氰菊酯 + TX、戊環苄呋菊酯(bioethanomethrin) + TX、生物氯菊酯 + TX、雙(2-氯乙基)醚 + TX、硼砂 + TX、溴苯烯磷 + TX、溴-DDT + TX、合殺威 + TX、畜蟲威 + TX、特嘧硫磷(butathiofos) + TX、丁酯磷 + TX、砷酸鈣 + TX、氰化鈣 + TX、二硫化碳 + TX、四氯化碳 + TX、巴丹鹽酸鹽 + TX、瑟瓦定(cevadine) + TX、冰片丹 + TX、氯丹 + TX、十氯酮 + TX、氯仿 + TX、氯化苦 + TX、氯腈肟磷 + TX、氯吡啶磷(chlorprazophos) + TX、順式苄呋菊酯(cis-resmethrin) + TX、

順式苜呋菊酯 (cismethrin) + TX、氰菊酯 (clopythrin) + TX、乙醯亞砷酸銅 + TX、砷酸銅 + TX、油酸銅 + TX、畜蟲磷 (coumthoate) + TX、冰晶石 + TX、CS 708 + TX、苯腈磷 + TX、殺螟腈 + TX、環蟲菊 + TX、賽滅磷 + TX、d-胺菊酯 + TX、DAEP + TX、棉隆 + TX、脫甲基克百威 (decarbofuran) + TX、除線特 + TX、異氯磷 + TX、除線磷 + TX、迪克萊賽爾 + TX、環蟲腈 + TX、狄氏劑 + TX、二乙基5-甲基吡啶-3-基磷酸酯 + TX、喘定 (dior) + TX、四氟甲醚菊酯 + TX、地麥威 + TX、苜菊酯 + TX、甲基毒蟲畏 + TX、敵蠅威 + TX、丙硝酚 + TX、戊硝酚 + TX、地樂酚 + TX、苯蟲醚 + TX、蔬果磷 + TX、噻喃磷 + TX、DSP + TX、脫皮甾酮 + TX、EI 1642 + TX、EMPC + TX、EPBP + TX、郡丙硫磷 + TX、乙硫苯威 + TX、甲酸乙酯 + TX、二溴乙烷 + TX、二氯乙烷 + TX、環氧乙烷 + TX、EXD + TX、皮蠅磷 + TX、乙苯威 + TX、殺螟硫磷 + TX、氧嘧啶胺 (fenoxacrim) + TX、吡氯氰菊酯 + TX、豐索磷 + TX、乙基倍硫磷 + TX、氟氯雙苯隆 (flucifuron) + TX、丁苯硫磷 + TX、磷砒酯 + TX、丁環硫磷 + TX、呋線威 + TX、抗蟲菊 + TX、雙胍辛鹽 + TX、雙胍辛乙酸鹽 + TX、四硫代碳酸鈉 + TX、苜蟎醚 + TX、HCH + TX、HEOD + TX、七氯 + TX、速殺硫磷 + TX、HHDN + TX、氰化氫 + TX、喹啉威 + TX、IPSP + TX、氯唑磷 + TX、碳氯靈 + TX、異艾氏劑 + TX、異柳磷 + TX、移栽靈 + TX、稻瘟靈 + TX、惡唑磷 + TX、保幼激素I + TX、保幼激素II + TX、保幼激素III + TX、氯戊環 + TX、烯蟲炔酯 + TX、砷酸鉛 + TX、溴苯磷 + TX、啞蟲磷 + TX、噻唑磷 + TX、間異丙苯基甲基胺基甲酸酯 + TX、磷化鎂 + TX、疊氮磷 + TX、甲基滅蚜磷 + TX、滅蚜硫磷 + TX、氯化亞汞 + TX、甲亞砷磷 + TX、威百畝 + TX、威百畝鉀鹽 + TX、威百畝鈉鹽 + TX、甲基磺醯氟 + TX、丁烯胺磷 + TX、甲氧普林 + TX、甲醚菊酯 + TX、甲氧滴滴涕 + TX、異硫氰酸甲酯 + TX、甲基氯仿 + TX、二氯甲烷 + TX、惡蟲酮 + TX、滅蟻靈 + TX、奈肽



磷 + TX、萘 + TX、NC-170 + TX、菸鹼 + TX、硫酸菸鹼 + TX、硝蟲噻 + TX、  
 原菸鹼 + TX、O-5-二氯-4-碘苯基O-乙基乙基硫代膦酸酯 + TX、O,O-二乙基O-  
 4-甲基-2-側氧基-2H-苯并哌喃-7-基硫代膦酸酯 + TX、O,O-二乙基O-6-甲基-2-丙  
 基嘧啶-4-基硫代膦酸酯 + TX、O,O,O',O'-四丙基二硫代焦磷酸酯 + TX、油酸 +  
 TX、對-二氯苯 + TX、甲基對硫磷 + TX、五氯苯酚 + TX、月桂酸五氯苯酯 +  
 TX、PH 60-38 + TX、芬硫磷 + TX、對氯硫磷 + TX、磷化氫 + TX、甲基辛硫  
 磷 + TX、甲胺嘧磷 + TX、多氯二環戊二烯異構物 + TX、亞砷酸鉀 + TX、硫  
 氰酸鉀 + TX、早熟素I + TX、早熟素II + TX、早熟素III + TX、醯胺嘧啶磷 +  
 TX、丙氟菊酯 + TX、猛殺威 + TX、丙硫磷 + TX、吡菌磷 + TX、反滅蟲菊 +  
 TX、苦木萃取物 (quassia) + TX、喹硫磷-甲基 + TX、畜寧磷 + TX、碘柳胺  
 + TX、苜呋菊脂 + TX、魚藤酮 + TX、噁噁菊酯 + TX、魚尼汀 + TX、利阿諾  
 定 + TX、沙巴黎蘆 (sabadilla) + TX、八甲磷 + TX、克線丹 + TX、SI-0009  
 + TX、噁丙腈 + TX、亞砷酸鈉 + TX、氰化鈉 + TX、氟化鈉 + TX、六氟矽酸  
 鈉 + TX、五氯苯酚鈉 + TX、硒酸鈉 + TX、硫氰酸鈉 + TX、磺苯醌隆  
 (sulcofuron) + TX、磺苯醌隆鈉鹽 (sulcofuron-sodium) + TX、硫醯氟 + TX、  
 硫丙磷 + TX、焦油 + TX、噁蟎威 + TX、TDE + TX、丁基嘧啶磷 + TX、雙硫  
 磷 + TX、環戊烯丙菊酯 + TX、四氯乙烷 + TX、噁氯磷 + TX、殺蟲環 + TX、  
 殺蟲環草酸鹽 + TX、蟲線磷 + TX、殺蟲單 + TX、殺蟲單鈉 + TX、四溴菊酯  
 + TX、反氯菊酯 + TX、啞蚜威 + TX、異皮蠅磷-3 (trichlormetaphos-3) + TX、  
 毒壤磷 + TX、混殺威 + TX、三氟甲氧威 (tolprocarb) + TX、氯啞菌酯 + TX、  
 烯蟲硫酯 + TX、藜蘆定 + TX、藜蘆鹼 + TX、XMC + TX、ζ-氯氰菊酯 + TX、  
 磷化鋅 + TX、啞蟲磷 + TX、以及氯氟醚菊酯 + TX、四氟醚菊酯 + TX、雙(三  
 丁基錫)氧化物 + TX、溴乙醯胺 + TX、磷酸鐵 + TX、氯硝柳胺-乙醇胺 + TX、  
 三丁基氧化錫 + TX、吡啉 + TX、蝸螺殺 + TX、1,2-二溴-3-氯丙烷 + TX、1,3-

二氯丙烯 + TX、3,4-二氯四氫噻吩1,1-二氧化物 + TX、3-(4-氯苯基)-5-甲基玫瑰寧 + TX、5-甲基-6-硫酮基-1,3,5-噻二吡-3-基乙酸 + TX、6-異戊烯基胺基嘌呤 + TX、2-氟-N-(3-甲氧基苯基)-9H-嘌呤-6-胺 + TX、苯氯噻 + TX、細胞分裂素 + TX、DCIP + TX、糠醛 + TX、異醯胺磷 + TX、激動素 + TX、疣孢漆斑菌組成物 + TX、四氯噻吩 + TX、二甲苯酚 + TX、玉米素 + TX、乙基黃原酸鉀 + TX、阿拉酸式苯 + TX、阿拉酸式苯-S-甲基 + TX、大虎杖萃取物 + TX、 $\alpha$ -氯代醇 + TX、安妥 + TX、碳酸鋇 + TX、雙鼠脲 + TX、溴鼠隆 + TX、溴敵隆 + TX、溴鼠胺 + TX、氯鼠酮 + TX、膽鈣化醇 + TX、氯殺鼠靈 + TX、克滅鼠 + TX、殺鼠萘 + TX、殺鼠嘧啶 + TX、鼠得克 + TX、噻鼠靈 + TX、敵鼠 + TX、鈣化醇 + TX、氟鼠靈 + TX、氟乙醯胺 + TX、氟鼠啶 + TX、氟鼠啶鹽酸鹽 + TX、鼠特靈 + TX、毒鼠磷 + TX、磷 + TX、殺鼠酮 + TX、滅鼠優 + TX、海蔥糖苷 + TX、氟乙酸鈉 + TX、硫酸鉍 + TX、殺鼠靈 + TX、2-(2-丁氧基乙氧基)乙基胡椒酸酯 + TX、5-(1,3-苯并二氧雜環戊烯-5-基)-3-己基環己-2-烯酮 + TX、具有橙花三級醇的茵綠烯醇 + TX、增效炔醚 + TX、MGK 264 + TX、胡椒基丁醚 + TX、增效醛 + TX、丙基異構物 + TX、S421 + TX、增效散 + TX、芝麻林素 + TX、亞砒 + TX、蔥醌 + TX、環烷酸銅 + TX、王銅 + TX、二環戊二烯 + TX、塞侖 + TX、環烷酸鋅 + TX、福美鋅 + TX、衣馬寧 + TX、利巴韋林 + TX、氧化汞 + TX、甲基托布津 + TX、阿紮康唑 + TX、聯苯三唑醇 + TX、糠菌唑 + TX、環唑醇 + TX、苯醚甲環唑 + TX、烯唑醇 + TX、氟環唑 + TX、腈苯唑 + TX、氟啞唑 + TX、氟矽唑 + TX、粉唑醇 + TX、呋吡菌胺 + TX、己唑醇 + TX、抑黴唑 + TX、亞胺唑 + TX、種菌唑 + TX、葉菌唑 + TX、腈菌唑 + TX、多效唑 + TX、稻瘟酯 + TX、戊菌唑 + TX、丙硫菌唑 + TX、啞斑脞 (pyrifenoX) + TX、咪鮮胺 + TX、丙環唑 + TX、啞菌唑 + TX、矽氟唑 (simeconazole) + TX、戊唑醇 + TX、氟醚唑 + TX、三唑酮 + TX、三唑醇 + TX、氟菌唑 + TX、

滅菌唑 + TX、嘧啶醇 + TX、氯苯嘧啶醇 + TX、氟苯嘧啶醇 + TX、乙嘧吩磺  
 酸酯 (bupirimate) + TX、甲菌定 (dimethirimol) + TX、乙菌定 (ethirimol)  
 + TX、十二環啉 + TX、苯鏽啶 + TX、丁苯啉 + TX、螺環菌胺 + TX、十三啉  
 + TX、嘧菌環胺 + TX、嘧菌胺 + TX、嘧黴胺 (pyrimethanil) + TX、拌種咯 +  
 TX、咯菌腈 + TX、苯霜靈 (benalaxyl) + TX、呋霜靈 (furalaxyl) + TX、甲  
 霜靈 + TX、R-甲霜靈 + TX、呋醯胺 + TX、惡霜靈 (oxadixyl) + TX、多菌靈  
 + TX、咪菌威 (debacarb) + TX、麥穗寧 + TX、噻苯達唑 + TX、乙菌利  
 (chlozolinate) + TX、菌核利 (dichlozoline) + TX、甲菌利 (myclozoline) +  
 TX、腐黴利 (procymidone) + TX、乙烯菌核利 (vinclozoline) + TX、啶醯菌  
 胺 (boscalid) + TX、萎鏽靈 + TX、甲呋醯胺 + TX、氟醯胺 (flutolanil) + TX、  
 滅鏽胺 + TX、氧化萎鏽靈 + TX、吡噻菌胺 (penthioopyrad) + TX、噻呋醯胺 +  
 TX、多果定 + TX、雙胍辛胺 + TX、嘧菌酯 + TX、醚菌胺 + TX、烯肟菌酯  
 (enestroburin) + TX、烯肟菌胺 + TX、氟菌蟎酯 + TX、氟嘧菌酯 + TX、醚  
 菌酯 + TX、苯氧菌胺 + TX、肟菌酯 + TX、肟醚菌胺 + TX、啶氧菌酯 + TX、  
 唑菌胺酯 + TX、唑胺菌酯 + TX、唑菌酯 + TX、福美鐵 + TX、代森錳鋅 + TX、  
 代森錳 + TX、代森聯 + TX、甲基代森鋅 + TX、代森鋅 + TX、敵菌丹 + TX、  
 克菌丹 + TX、唑呋草 + TX、滅菌丹 + TX、對甲抑菌靈 + TX、波爾多混合劑  
 + TX、氧化銅 + TX、代森錳銅 + TX、喹啉銅 + TX、酞菌酯 + TX、克瘟散 +  
 TX、異稻瘟淨 + TX、氯瘟磷 + TX、甲基立枯磷 + TX、敵菌靈 + TX、苯噻菌  
 胺 + TX、滅瘟素 (blasticidin) + TX、地茂散 (chloroneb) + TX、百菌清 +  
 TX、環氟菌胺 + TX、霜脲氰 + TX、三氟吡啶胺 + TX、雙氯氰菌胺 (diclocymet)  
 + TX、噻菌酮 (diclomezine) + TX、氯硝胺 (dicloran) + TX、乙黴威 (diethofencarb)  
 + TX、烯醯啉 + TX、氟啉 + TX、二噻農 (dithianon) + TX、噻唑菌胺 (ethaboxam)  
 + TX、土菌靈 (etridiazole) + TX、惡唑菌酮 + TX、咪唑菌酮 (fenamidone)

+ TX、稻瘟醯胺 (fenoxanil) + TX、嘧菌腓 (ferimzone) + TX、氟啶胺 (fluazinam) + TX、氟吡菌胺 (fluopicolide) + TX、磺菌胺 (flusulfamide) + TX、氟唑菌醯胺 + TX、環醯菌胺 + TX、三乙膦酸鋁 (fosetyl-aluminium) + TX、惡黴靈 (hymexazol) + TX、丙森鋅 + TX、賽座滅 (cyazofamid) + TX、磺菌威 (methasulfocarb) + TX、苯菌酮 + TX、戊菌隆 (pencycuron) + TX、苯酞 + TX、多氧黴素 (polyoxins) + TX、霜黴威 (propamocarb) + TX、吡菌苯威 + TX、碘喹唑酮 (proquinazid) + TX、咯喹酮 (pyroquilon) + TX、苯啶菌酮 (pyriofenone) + TX、喹氧靈 + TX、五氯硝基苯 + TX、噻醯菌胺 + TX、咪唑吡啉 (triazoxide) + TX、三環唑 + TX、吡啶靈 + TX、有效黴素 + TX、瀨菌胺 + TX、苯醯菌胺 (zoxamide) + TX、雙炔醯菌胺 (mandipropamid) + TX、氟苯醚醯胺 (flubeneteram) + TX、吡啶萘菌胺 (isopyrazam) + TX、氟唑環菌胺 (sedaxane) + TX、苯并烯氟菌唑 + TX、氟唑菌醯羧胺 + TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酸(3',4',5'-三氟-聯苯-2-基)-醯胺 + TX、吡啶甲醯胺類殺菌劑 + TX、異噻菌胺 + TX、敵派美創 (dipymetitrone) + TX、6-乙基-5,7-二側氧基-吡咯并[4,5][1,4]二噻英并[1,2-c]異噻唑-3-甲脞 + TX、2-(二氟甲基)-N-[3-乙基-1,1-二甲基-二氫茛-4-基]吡啶-3-甲醯胺 + TX、4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基-噻吩-3-甲脞 + TX、(R)-3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[1,1,3-三甲基二氫茛-4-基]吡啶-4-甲醯胺 + TX、4-(2-溴-4-氟-苯基)-N-(2-氯-6-氟-苯基)-2,5-二甲基-吡啶-3-胺 + TX、4-(2-溴-4-氟-苯基)-N-(2-氯-6-氟-苯基)-1,3-二甲基-1H-吡啶-5-胺 + TX、氟茛唑菌胺 (fluidapyr) + TX、甲香菌酯 (jiexiangjunzhi) + TX、氯苯醚醯胺 + TX、二氯苯并噻唑 + TX、曼德斯賓 (mandestrobin) + TX、3-(4,4-二氟-3,4-二氫-3,3-二甲基異噻啉-1-基)噻啉酮 + TX、2-[2-氟-6-[(8-氟-2-甲基-3-噻啉基)氧基]苯基]丙-2-醇 + TX、噻啉菌靈 (oxathiapirolin) + TX、N-[6-[[[(1-甲基四唑-5-基)-苯基-亞甲基]胺基]氧基甲基]-2-吡啶基]胺基甲酸三級丁酯 + TX、聯苯吡菌

胺 + TX、琥珀酸脫氫酶抑制劑類殺菌劑 + TX、胺基甲酸酯類殺菌劑 + TX、氯  
 氟醚菌唑 + TX、伊芬三氟康唑 + TX、2-(二氟甲基)-N-[(3R)-3-乙基-1,1-二甲基  
 -二氫茛-4-基]吡啶-3-甲醯胺 + TX、N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲  
 基-甲脒 + TX、N'-[4-(4,5-二氯噻唑-2-基)氧基-2,5-二甲基-苯基]-N-乙基-N-甲基-  
 甲脒 + TX、[2-[3-[2-[1-[2-[3,5-雙(二氟甲基)吡唑-1-基]乙醯基]-4-哌啶基]噻唑-4-  
 基]-4,5-二氫異噁唑-5-基]-3-氯-苯基]甲磺酸酯 + TX、N-[6-[(Z)-[(1-甲基四唑-5-  
 基)-苯基-亞甲基]胺基]氧基甲基]-2-吡啶基]胺基甲酸丁-3-炔酯 + TX、N-[[5-[4-  
 (2,4-二甲基苯基)三唑-2-基]-2-甲基-苯基]甲基]胺基甲酸甲酯 + TX、3-氯-6-甲基  
 -5-苯基-4-(2,4,6-三氟苯基)嗒 + TX、苯基嗒類殺菌劑 + TX、3-(二氟甲基)-1-甲  
 基-N-[1,1,3-三甲基二氫茛-4-基]吡啶-4-甲醯胺 + TX、1-[2-[[1-(4-氯苯基)吡啶-3-  
 基]氧基甲基]-3-甲基-苯基]-4-甲基-四唑-5-酮 + TX、1-甲基-4-[3-甲基-2-[[2-甲基  
 -4-(3,4,5-三甲基吡啶-1-基)苯氧基]甲基]苯基]四唑-5-酮 + TX、胺基吡吩 + TX、  
 唑啉菌胺 + TX、吡啶菌醯胺 + TX、氟唑菌苯胺 + TX、(Z,2E)-5-[1-(4-氯苯基)  
 吡啶-3-基]氧基-2-甲氧基亞胺基-N,3-二甲基-戊-3-烯胺 + TX、吡啶菌醯胺 +  
 TX、苯吡克咪德 (fenpicoxamid) + TX、異丁乙氧喹啉 + TX、喹啉類殺菌劑 +  
 TX、喹啉菲莫啉 + TX、異丙噻菌胺 + TX、N-[2-[2,4-二氯-苯氧基]苯基]-3-(二  
 氟甲基)-1-甲基-吡啶-4-甲醯胺 + TX、N-[2-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]苯基]-3-  
 (二氟甲基)-1-甲基-吡啶-4-甲醯胺 + TX、苯噻菌酯 + TX、氟烯菌酯 + TX、5-胺  
 基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇鋅鹽 (2 : 1) + TX、氟吡菌醯胺 + TX、氟噻唑菌腈 +  
 TX、氟醚菌醯胺 + TX、吡啶甲醯胺類殺菌劑 + TX、哌碳唑 (picarbutrazox) +  
 TX、2-(二氟甲基)-N-(3-乙基-1,1-二甲基-二氫茛-4-基)吡啶-3-甲醯胺 + TX、2-(二  
 氟甲基)-N-((3R)-1,1,3-三甲基二氫茛-4-基)吡啶-3-甲醯胺 + TX、4-[[6-[2-(2,4-二  
 氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲腈 + TX、  
 四唑菌酮 + TX、2-(二氟甲基)-N-((3R)-1,1,3-三甲基二氫茛-4-基)吡啶-3-甲醯胺

+ TX、 $\alpha$ -(1,1-二甲基乙基)- $\alpha$ -[4'-(三氟甲氧基)[1,1'-二苯基]-4-基]-5-嘧啶甲醇 + TX、  
 TX、哌啶基噻唑異噁唑啉類殺菌劑 + TX、烯肟菌酯 (enoxastrobin) + TX、4-  
 [[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]  
 苯甲脒 + TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(5-氫硫基-1,2,4-三唑-1-  
 基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲脒 + TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-  
 3-(5-硫酮基-4H-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲脒 + TX、抗倒酯 +  
 TX、丁香菌酯 + TX、中生菌素 + TX、噻菌銅 + TX、噻唑鋅 + TX、阿米替林  
 + TX、異菌脲 + TX、N-辛基-N'-[2-(辛基胺基)乙基]乙烷-1,2-二胺 + TX；N'-[5-  
 溴-2-甲基-6-[(1S)-1-甲基-2-丙氧基-乙氧基]-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒 +  
 TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-[(1R)-1-甲基-2-丙氧基-乙氧基]-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基  
 -甲脒 + TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-  
 甲基-甲脒 + TX、N'-[5-氯-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基  
 -N-甲基-甲脒 + TX、N'-[5-溴-2-甲基-6-(1-甲基-2-丙氧基-乙氧基)-3-吡啶基]-N-  
 異丙基-N-甲基-甲脒 + TX (該等化合物可以由WO 2015/155075中描述之方法製  
 備)；N'-[5-溴-2-甲基-6-(2-丙氧基丙氧基)-3-吡啶基]-N-乙基-N-甲基-甲脒 + TX  
 (此化合物可以由IPCOM000249876D中描述之方法製備)；N-異丙基-N'-[5-甲氧  
 基-2-甲基-4-(2,2,2-三氟-1-羥基-1-苯基-乙基)苯基]-N-甲基-甲脒 + TX、N'-[4-(1-  
 環丙基-2,2,2-三氟-1-羥基-乙基)-5-甲氧基-2-甲基-苯基]-N-異丙基-N-甲基-甲脒  
 + TX (該等化合物可以由WO 2018/228896中描述之方法製備)；N-乙基-N'-[5-甲  
 氧基-2-甲基-4-[2-三氟甲基)氧雜環丁烷-2-基]苯基]-N-甲基-甲脒 + TX、N-乙基-  
 N'-[5-甲氧基-2-甲基-4-[2-三氟甲基)四氫呋喃-2-基]苯基]-N-甲基-甲脒 + TX (該  
 等化合物可以由WO 2019/110427中描述之方法製備)；N-[(1R)-1-苄基-3-氯-1-甲  
 基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-[(1S)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基]-  
 8-氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-[(1R)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-

甲醯胺 + TX、N-[(1S)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-[(1R)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-[(1S)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、8-氟-N-[(1R)-1-[(3-氟苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲醯胺 + TX、8-氟-N-[(1S)-1-[(3-氟苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-[(1R)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-[(1S)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-[(1R)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX、N-[(1S)-1-苄基-3-氯-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺 + TX(該等化合物可以由WO 2017/153380中描述之方法製備)；1-(6,7-二甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4,5-三氟-3,3-二甲基-異喹啉 + TX、1-(6,7-二甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4,6-三氟-3,3-二甲基-異喹啉 + TX、4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(6-甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)異喹啉 + TX、4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(7-甲基吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)異喹啉 + TX、1-(6-氯-7-甲基-吡啶并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-異喹啉 + TX(該等化合物可以由WO 2017/025510中描述之方法製備)；1-(4,5-二甲基苯并咪唑-1-基)-4,4,5-三氟-3,3-二甲基-異喹啉 + TX、1-(4,5-二甲基苯并咪唑-1-基)-4,4-二氟-3,3-二甲基-異喹啉 + TX、6-氯-4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(4-甲基苯并咪唑-1-基)異喹啉 + TX、4,4-二氟-1-(5-氟-4-甲基-苯并咪唑-1-基)-3,3-二甲基-異喹啉 + TX、3-(4,4-二氟-3,3-二甲基-1-異喹啉基)-7,8-二氫-6H-環戊二烯并[e]苯并咪唑 + TX(該等化合物可以由WO 2016/156085中描述之方法製備)；N-甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]環丙烷甲醯胺 + TX、N,2-二甲氧基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙醯胺 + TX、N-乙基-2-甲基-N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙醯胺 + TX、1-甲氧基-3-甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲 + TX、1,3-二甲氧基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲 + TX、3-乙基-1-甲氧基-1-[[4-[5-

(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]脲 + TX、N-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]丙醯胺 + TX、4,4-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]異噁唑啉-3-酮 + TX、5,5-二甲基-2-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]異噁唑啉-3-酮 + TX、1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡啶-4-甲酸乙酯 + TX、N,N-二甲基-1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]-1,2,4-三唑-3-胺 + TX。此段落中的化合物可以由WO 2017/055473、WO 2017/055469、WO 2017/093348和WO 2017/118689中描述之方法製備；2-[6-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇 + TX（此化合物可以由WO 2017/029179中描述之方法製備）；2-[6-(4-溴苯氧基)-2-(三氟甲基)-3-吡啶基]-1-(1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇 + TX（此化合物可以由WO 2017/029179中描述之方法製備）；3-[2-(1-氯環丙基)-3-(2-氟苯基)-2-羥基-丙基]咪唑-4-甲腈 + TX（此化合物可以由WO 2016/156290中描述之方法製備）；3-[2-(1-氯環丙基)-3-(3-氯-2-氟-苯基)-2-羥基-丙基]咪唑-4-甲腈 + TX（此化合物可以由WO 2016/156290中描述之方法製備）；2-胺基-6-甲基-吡啶-3-甲酸(4-苯氧基苯基)甲酯 + TX（此化合物可以由WO 2014/006945中描述之方法製備）；2,6-二甲基-1H,5H-[1,4]二噻英并[2,3-c:5,6-c']聯吡咯-1,3,5,7(2H,6H)-四酮 + TX（此化合物可以由WO 2011/138281中描述之方法製備）；N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]硫代苯甲醯胺 + TX；N-甲基-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺 + TX；(Z,2E)-5-[1-(2,4-二氯苯基)吡啶-3-基]氧基-2-甲氧基亞胺基-N,3-二甲基-戊-3-烯胺 + TX（此化合物可以由WO 2018/153707中描述之方法製備）；N'-(2-氯-5-甲基-4-苯氧基-苯基)-N-乙基-N-甲基-甲脒 + TX；N'-[2-氯-4-(2-氟苯氧基)-5-甲基-苯基]-N-乙基-N-甲基-甲脒 + TX（此化合物可以由WO 2016/202742中描述之方法製備）；2-(二氟甲基)-N-[(3S)-3-乙基-1,1-二甲基-二氫茚-4-基]吡啶-3-甲醯胺 + TX（此化合物可以由WO 2014/095675中描述之方法製備）；(5-甲基-2-吡啶基)-



[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲酮 + TX、(3-甲基異噁唑-5-基)-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲酮 + TX (該等化合物可以由WO 2017/220485中描述之方法製備); 2-側氧基-N-丙基-2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙醯胺 + TX (此化合物可以由WO 2018/065414中描述之方法製備); 1-[5-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]-2-噻吩基]甲基吡唑-4-甲酸乙酯 + TX (此化合物可以由WO 2018/158365中描述之方法製備); 2,2-二氟-N-甲基-2-[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]乙醯胺 + TX、N-[(E)-甲氧基亞胺基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺 + TX、N-[(Z)-甲氧基亞胺基甲基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺 + TX、N-[N-甲氧基-C-甲基-碳醯亞胺基]-4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯甲醯胺 + TX (該等化合物可以由WO 2018/202428中描述之方法製備)、氯吡啶醯肼 + TX、嘧啶類殺菌劑 + TX、氟康唑 + TX、氟蟲胺嘧啶 (flufenoxadiazam) + TX、甲基吡蟲胺 (metarylpicoxamid) + TX。

【0225】 在活性成分之後的括弧中的參考號例如[3878-19-1]是指化學文摘登記號。上文描述的混合配伍物係已知的。在活性成分包括在「The Pesticide Manual [殺有害生物劑手冊]」[The Pesticide Manual - A World Compendium [殺有害生物劑手冊-全球概覽]; 第13版; 編輯: C. D. S. Tomlin; The British Crop Protection Council [英國農作物保護委員會]]中的情況下,它們在其中以上文對於特定化合物的圓括號中所給出的條目編號來描述; 例如化合物「阿維菌素」以條目編號 (1) 來描述。在「[CCN]」在上文添加到特定化合物的情況下,所述之化合物包括在「Compendium of Pesticide Common Names[殺有害生物劑通用名綱要]」中,其可以在互聯網[A. Wood; Compendium of Pesticide Common Names, Copyright © 1995-2004]上獲得; 例如,化合物「乙醯蟲脞」描述於互聯網地址 <http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html> 中。

【0226】 多數上述活性成分在上文中藉由所謂的「通用名」來提及，在單個情形中使用相應的「ISO通用名」或另一「通用名」。若名稱不是「通用名」，則所使用的名稱種類以特定化合物的圓括號中所給出的名稱來代替；在這種情況下，使用IUPAC名稱、IUPAC/化學文摘名、「化學名稱」、「慣用名」、「化合物名稱」或「開發代碼」，或若既不使用那些名稱之一也不使用「通用名」，則使用「別名」。「CAS登記號」意指化學文摘登記號。

【0227】 選自由具有式 (I)、(Ia)、(Ia-A)、(Ia-B) 或 (Ia-C) 的化合物組成之群組的化合物，或選自由如表C-1至C-21中所示的化合物組成之群組的一種化合物，或如（下）表P中列出的化合物的活性成分混合物：較佳的是以從100：1至1：100、尤其是從50：1至1：50、更尤其是從20：1至1：20的比率、甚至更尤其是從10：1至1：10、並且還更尤其是從5：1至1：5的混合比率。那些混合比率係按重量計的。

【0228】 如上所述之混合物可以被用於控制有害生物之方法中，該方法包括將包含如上所述之混合物的組成物施用於有害生物或其環境中，藉由手術或療法用於處理人或動物體之方法以及在人或動物體上實施的診斷方法除外。

【0229】 包含選自具有式 (I)、(Ia)、(Ia-A)、(Ia-B)、(Ia-C) 的化合物的化合物，或選自由如表C-1至C-21中所示的化合物組成之群組的一種化合物，或如（下）表P中列出的化合物、以及一種或多種如上所述之活性成分的混合物可以例如以單一的「摻水即用（ready-mix）」的形式施用，以組合的噴霧混合物（該混合物由單一活性成分組分的單獨配製物構成）（如「桶混製劑（tank-mix）」）施用，並且當以相繼的方式（即，一個在另一個適度短的時期之後，如幾小時或幾天）施用時組合使用該等單一活性成分來施用。施用選自具有式 (I)、(Ia)、(Ia-A)、(Ia-B)、(Ia-C) 的化合物的化合物，或選自由如表C-1至C-21中所示的化合物組成之群組的一種化合物，或如（下）表P中列出的化合物：與如上所述之一種

或多種活性成分的順序對於實施本發明並不是關鍵的。

**【0230】** 根據本發明之組成物還可以包含另外的固體或液體助劑，如穩定劑，例如未環氧化的或環氧化的植物油（例如環氧化的椰子油、菜籽油或大豆油），消泡劑（例如矽酮油），防腐劑，黏度調節劑，黏合劑和/或增黏劑，肥料或其他用於獲得特定效果的活性成分，例如殺細菌劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、植物活化劑、殺軟體動物劑或除草劑。

**【0231】** 根據本發明之組成物係以本身已知的方式，在不存在助劑的情況下，例如藉由研磨、篩選和/或壓縮固體活性成分；和在至少一種助劑的存在下，例如藉由緊密混合活性成分與一種或多種助劑和/或將活性成分與一種或多種助劑一起研磨來製備。用於製備組成物的該等方法和用於製備該等組成物的化合物 (I) 之用途也是本發明之主題。

**【0232】** 本發明之另一方面關於根據本發明之具有式 (I) 的化合物的或較佳的如本文所定義的各種化合物的、包含至少一種具有式 (I) 的化合物或至少一種較佳的如本文所定義的各種化合物的組成物的、或包含至少一種具有式 (I) 的化合物或至少一種較佳的如本文所定義的各種化合物（與如以上所述之其他殺真菌劑或殺昆蟲劑混合）的殺真菌或殺昆蟲混合物的用於控制或預防植物（例如有用植物（如作物植物）、其繁殖材料（例如種子）、收穫的作物（例如收穫的糧食作物）、或非生命材料被昆蟲或植物病原性微生物（較佳的是真菌有機體）侵染之用途。

**【0233】** 本發明之另一方面關於一種控制或預防植物（例如有用植物（如作物植物）、其繁殖材料（例如種子）、收穫的作物（例如收穫的糧食作物）、或非生命材料被植物病原性微生物或腐敗微生物或對人潛在有害的有機體（尤其是真菌有機體）侵染之方法，該方法包括將根據本發明之具有式 (I) 的化合物或較佳的如本文所定義的各種化合物作為活性成分施用至該等植物、該等植物的

部分或其場所、其繁殖材料、或該等非生命材料的任何部分。

**【0234】** 控制或預防意指將被昆蟲或植物病原性微生物或腐敗微生物或對人潛在有害的有機體（尤其是真菌有機體）的侵染減少至這樣一個被證明改進的水平。

**【0235】** 控制或預防作物植物被植物病原性微生物（尤其是真菌有機體）或昆蟲侵染的較佳之方法係葉面施用，該方法包括施用根據本發明之具有式 (I) 的化合物、或含有至少一種具有式 (I) 的化合物的農用化學組成物。施用頻率和施用比率將取決於受相應的病原體或昆蟲侵染的風險。然而，根據本發明之具有式 (I) 的化合物還可以藉由用液體配製物浸泡植物的場所或者藉由將以固體形式的化合物例如以顆粒形式施用至土壤（土壤施用）而經由土壤通過根（系統作用）滲透植物。在水稻作物中，可以將此類顆粒劑施用至灌水的稻田中。具有式 (I) 的化合物還可以藉由用殺真菌劑的液體配製物浸漬種子或塊莖、或用固體配製物對其進行包衣而施用到種子（包衣）上。

**【0236】** 配製物（例如含有根據本發明之具有式 (I) 的化合物、以及（如果需要）固體或液體佐劑或用於封裝具有式 (I) 的化合物的單體的組成物）可以按已知方式製備，典型地藉由將化合物與補充劑（例如溶劑、固體載體以及視需要表面活性化合物（表面活性劑））密切地混合和/或研磨。

**【0237】** 有利的施用比率通常是從5 g至2 kg的活性成分（a.i.）/公頃（ha），較佳的是從10 g至1 kg a.i./ha，最佳的是從20 g至600 g a.i./ha。當作為種子浸泡試劑使用時，適當的劑量係從10 mg至1 g活性物質/kg種子。

**【0238】** 如本文使用的，術語「g a.i./ha」是指以每單位表面[ha]的活性成分[a.i.]的克[g]給出的施用比率。單位公頃（符號ha）係等於具有100 m邊長（1 hm<sup>2</sup>）或10,000平方米的正方形的面積的公制單位。公頃係公制中常用的面積單位。

【0239】 當本發明之組合用於處理種子時，0.001至50 g 具有式 (I) 的化合物/kg種子、較佳的是從0.01至10 g/kg種子的施用比率總體上係足夠的。

【0240】 適當地，預防性（意指在病害發展之前）或治療性（意指在病害發展之後）施用包含根據本發明之具有式 (I) 的化合物的組成物。

【0241】 本發明之組成物可以以任何常規形式使用，例如以雙包裝、乾種子處理用的粉劑（DS）、種子處理用的乳液（ES）、種子處理用的可流動性濃縮物（FS）、種子處理用的溶液（LS）、種子處理用的水分散性粉劑（WS）、種子處理用的膠囊懸浮液（CF）、種子處理用的凝膠（GF）、乳液濃縮物（EC）、懸浮液濃縮物（SC）、懸浮乳液（SE）、膠囊懸浮液（CS）、水分散性顆粒（WG）、可乳化性顆粒（EG）、油包水型乳液（EO）、水包油型乳液（EW）、微乳液（ME）、可分散油懸浮劑（OD）、油懸劑（OF）、油溶性液劑（OL）、可溶性濃縮物（SL）、超低容量懸浮劑（SU）、超低容量液劑（UL）、母藥（TK）、可分散性濃縮物（DC）、可濕性粉劑（WP）或與農業上可接受的佐劑組合的任何技術上可行的配製物的形式使用。

【0242】 能以常規方式生產此類組成物，例如藉由混合活性成分與適當的配製物惰性劑（稀釋劑、溶劑、填料及視需要其他配製成分，如表面活性劑、殺生物劑、防凍劑、黏著劑、增稠劑及提供輔助效果的化合物）。還可以使用旨在長期持續功效的常規緩釋配製物。特別地，待以噴霧形式，如水可分散性濃縮物（例如EC、SC、DC、OD、SE、EW、EO等）、可濕性粉劑及顆粒施用的配製物可包含表面活性劑如濕潤劑和分散劑及提供輔助效果的其他化合物，例如甲醛與萘磺酸鹽、烷芳基磺酸鹽、木質素磺酸鹽、脂肪烷基硫酸鹽及乙氧基化烷基酚和乙氧基化脂肪醇的縮合產物。

【0243】 使用本發明之組合和稀釋劑以合適的拌種配製物形式（例如具有對種子的良好黏著性的水性懸浮液或乾粉劑形式）以本身已知的方式將拌種配

製物施用至種子。此類拌種配製物在本領域係已知的。拌種配製物可以含有包囊形式的單一活性成分或活性成分的組合，例如作為緩釋膠囊或微膠囊。

**【0244】** 通常，該等配製物包含按重量計從0.01%至90%的活性劑、從0%至20%的農業上可接受的表面活性劑和10%至99.99%的固體或液體配製惰性劑以及一種或多種佐劑，該活性劑由至少根據本發明之具有式 (I) 的化合物視需要連同其他活性劑（特別是殺微生物劑或防腐劑等）一起組成。組成物的濃縮形式通常含有按重量計在約2%與80%之間、較佳的是在約5%與70%之間的活性劑。配製物的施用形式可以例如含有按重量計從0.01%至20%、較佳的是按重量計從0.01%至5%的活性劑。然而商用的產品將較佳的是被配製為濃縮物，最終使用者將通常使用稀釋的配製物。

**【0245】** 然而較佳的是將商用的產品配製為濃縮物，最終使用者將通常使用稀釋的配製物。

**【0246】** 施用比率在寬範圍之內變化並且取決於土壤的性質、施用方法、作物植物、待控制的有害生物、主要氣候條件、以及受施用方法、施用時間以及目標作物支配的其他因素。一般來講，可以將化合物以從1至2000 l/ha、尤其是從10至1000 l/ha的比率施用。

**【0247】** 較佳的配製物可以具有以下組成（重量%）：

可乳化濃縮物：

活性成分： 1%至95%，較佳的是60%至90%

表面活性劑： 1%至30%，較佳的是5%至20%

液體載體： 1%至80%，較佳的是1%至35%

塵粉劑：

活性成分： 0.1%至10%，較佳的是0.1%至5%

固體載體： 99.9%至90%，較佳的是99.9%至99%

懸浮液濃縮物：

活性成分： 5%至75%，較佳的是10%至50%

水： 94%至24%，較佳的是88%至30%

表面活性劑： 1%至40%，較佳的是2%至30%

可濕性粉劑：

活性成分： 0.5%至90%，較佳的是1%至80%

表面活性劑： 0.5%至20%，較佳的是1%至15%

固體載體： 5%至95%，較佳的是15%至90%

顆粒劑：

活性成分： 0.1%至30%，較佳的是0.1%至15%

固體載體： 99.5%至70%，較佳的是97%至85%

**【0248】** 本申請的揭露內容使得可獲得在本文中揭露的實施方式的每種組合。

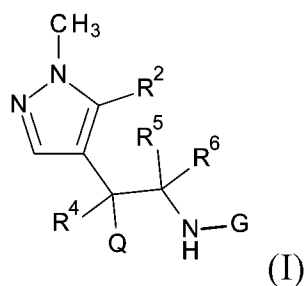
**【0249】** 根據以下表C-1至C-21的化合物可以根據上述方法製備。隨後的該等實例旨在說明本發明並且展示較佳的具有式 (I) 的化合物。在以下表C-1至C-21的任一項中，在根據本發明之具有式 (I) 的化合物中一個或多個可能的不對稱碳原子的存在意味著該等化合物能以手性異構物形式存在，即，鏡像異構物或非鏡像異構物的形式。

**【0250】** 本申請的揭露內容使得可獲得在本文中揭露的實施方式的每種組合。

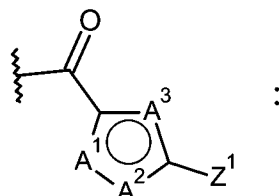
**【0251】** 根據以下表C-1至C-21的化合物可以根據上述方法製備。隨後的該等實例旨在說明本發明並且展示較佳的具有式 (I) 的化合物。

**【0252】 [表A]：**

此表揭露了具有式 (I) 的20個取代基定義G



其中G具有如以下所定義的式

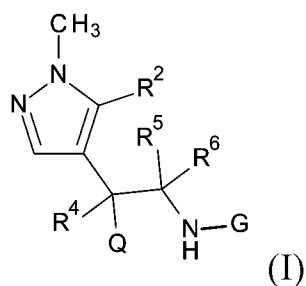


索引	G	索引	G
1	[2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-羰基]	11	[2-(2-氟苯基)四唑-5-羰基]
2	[2-(2,4-二氟苯基)三唑-4-羰基]	12	[2-(2-氟苯基)三唑-4-羰基]
3	[1-(2,4-二氟苯基)三唑-4-羰基]	13	[1-(2-氟苯基)三唑-4-羰基]
4	[2-(3,5-二氟-2-吡啶基)四唑-5-羰基]	14	(2-苯基四唑-5-羰基)
5	[2-(3,5-二氟-2-吡啶基)三唑-4-羰基]	15	(2-苯基三唑-4-羰基)
6	[1-(3,5-二氟-2-吡啶基)三唑-4-羰基]	16	(1-苯基三唑-4-羰基)
7	[2-(4-氟苯基)四唑-5-羰基]	17	[1-(2,4-二氟苯基)吡唑-4-羰基]
8	[2-(5-氟-2-吡啶基)四唑-5-羰基]	18	[1-(2,4-二氟苯基)吡唑-3-羰基]
9	[2-(4-氟苯基)三唑-4-羰基]	19	[1-(2,4-二氟苯基)-1,2,4-三唑-3-羰基]
10	[1-(4-氟苯基)三唑-4-羰基]	20	[1-(2,4-二氟苯基)吡咯-3-羰基]

【0253】 [表B]：

此表揭露了具有式 (I) 的14個取代基定義Q



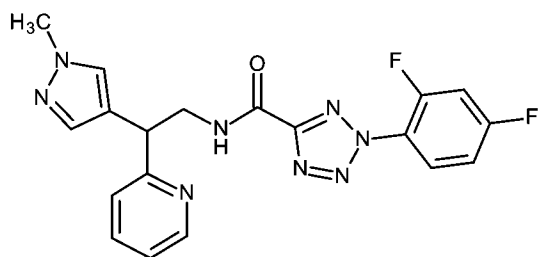


索引	Q	索引	Q
Q-1	2-吡啶基	Q-8	(6-環丙基-2-吡啶基)
Q-2	(6-氯-2-吡啶基)	Q-9	(6-氯-4-甲氧基-2-吡啶基)
Q-3	(6-溴-2-吡啶基)	Q-10	(6-氯-5-甲基-2-吡啶基)
Q-4	(6-甲基-2-吡啶基)	Q-11	(6-氯吡啶-2-基)
Q-5	(6-氰基-2-吡啶基)	Q-12	(2-氯嘧啶-4-基)
Q-6	(6-乙烯基-2-吡啶基)	Q-13	(6-氯嗒吡-3-基)
Q-7	[6-(三氟甲基)-2-吡啶基]	Q-14	(6-氰基吡啶-2-基)

【0254】 表C-1至C-21揭露了具有式 (I) 的本發明之特定化合物，其中Q和G取代基係如表A和B中所定義的。

【0255】 表C-1：此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-1.01至C-1.20，其中R<sup>2</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>係H，Q係如表B中所定義的Q-1，並且G係如表A中所定義的。

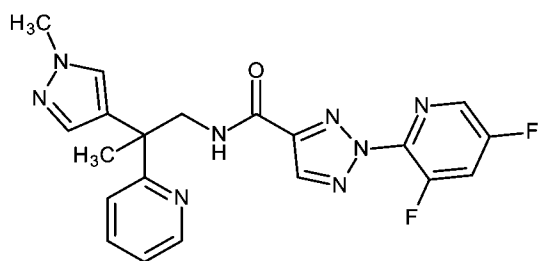
例如，化合物C-1.01具有以下結構：



化合物C-1.01

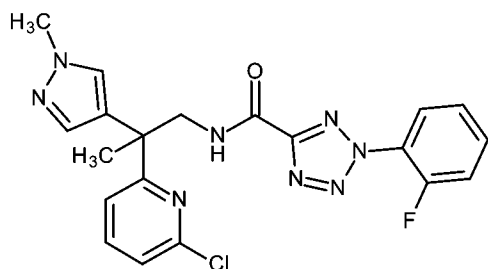
【0256】 表C-2：此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-2.01至C-2.20，其中R<sup>2</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>係H，R<sup>4</sup>係CH<sub>3</sub>，Q係如表B中所定義的Q-1，並且G係如表A中所定義的。

例如，化合物C-2.05具有以下結構：



化合物C-2.05

【0257】 表C-3：此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-3.01至C-3.20，其中 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-2，並且G係如表A中所定義的。例如，化合物C-3.11具有以下結構；



化合物C-3.11

【0258】 表C-4：此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-4.01至C-4.20，其中 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-3，並且G係如表A中所定義的。

【0259】 表C-5：此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-5.01至C-5.20，其中 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-4，並且G係如表A中所定義的。

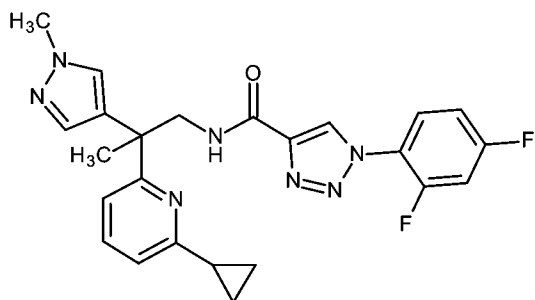
【0260】 表C-6：此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-6.01至C-6.20，其中 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-5，並且G係如表A中所定義的。

【0261】 表C-7：此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C7.01至C-7.20，其中 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-6，並且G係如表A中所定義的。

【0262】 表C-8：此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C8.01至C-8.20，其中 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-7，並且G係如表A中所定

義的。

**【0263】 表C-9:** 此表提供了12種具有式 (I) 的化合物C-9.01至C-9.20，其中 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-8，並且G係如表A中所定義的。例如，化合物C-9.03具有以下結構：



化合物C-9.03

**【0264】 表C-10:** 此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-10.01至C-10.20，其中 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-9，並且G係如表A中所定義的。

**【0265】 表C-11:** 此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-11.01至C-11.20，其中 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-10，並且G係如表A中所定義的。

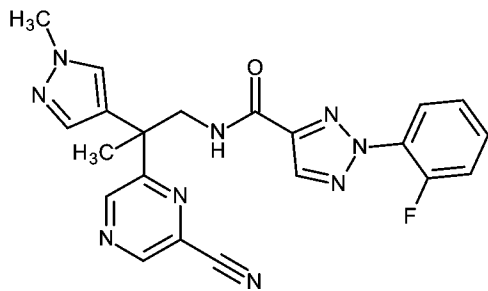
**【0266】 表C-12:** 此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-12.01至C-12.20，其中 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-11，並且G係如表A中所定義的。

**【0267】 表C-13:** 此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-13.01至C-13.20，其中 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-12，並且G係如表A中所定義的。

**【0268】 表C-14:** 此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-14.01至C-14.20，其中 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-13，並且G係如表A中所定義的。

**【0269】 表C-15:** 此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-15.01至C-15.20，

其中 $R^2$ 、 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-14，並且G係如表A中所定義的。例如，化合物C-15.12具有以下結構：



化合物C-15.12

**【0270】 表C-16:**此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-16.01至C-16.20，其中 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^2$ 和 $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-2，並且G係如表A中所定義的。

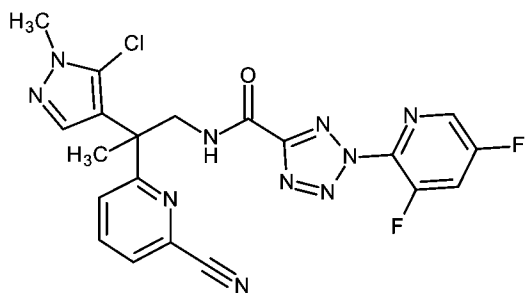
**【0271】 表C-17:**此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-17.01至C-17.20，其中 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^2$ 和 $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-3，並且G係如表A中所定義的。

**【0272】 表C-18:**此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-18.01至C-18.20，其中 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^2$ 和 $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-5，並且G係如表A中所定義的。例如，化合物C-18.01具有以下結構：

**【0273】 表C-19:**此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-19.01至C-19.20，其中 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^2$ 係Cl， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-2，並且G係如表A中所定義的。

**【0274】 表C-20:**此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-20.01至C-20.20，其中 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^2$ 係Cl， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-3，並且G係如表A中所定義的。

**【0275】 表C-21:**此表提供了20種具有式 (I) 的化合物C-21.01至C-21.20，其中 $R^5$ 、 $R^6$ 係H， $R^2$ 係Cl， $R^4$ 係 $CH_3$ ，Q係如表B中所定義的Q-5，並且G係如表A中所定義的。例如，化合物C-21.01具有以下結構：



化合物C-21.04

## 實施例

【0276】 隨後的實施例用來說明本發明並且不意味著以任何方式限制本發明。

【0277】 本發明之化合物與已知化合物的區別可以在於在低施用比率下更大的功效，這可以由熟悉該項技術者使用在實施例中概述的實驗程序，使用更低的施用比率（如果必要的話）例如，60 ppm、20 ppm或2 ppm來證實。

【0278】 具有式 (I) 的化合物可以具有許多益處，尤其包括針對保護植物對抗由真菌引起的病害的有利水平的生物活性或對於用作農用化學品活性成分的優越特性（例如，更高的生物活性、有利的活性範圍、增加的安全性（包括改善的作物耐受性）、改善的物理-化學特性、或增加的生物可降解性）。

【0279】 本說明書通篇中，以攝氏度（°C）給出溫度並且「m.p.」意指熔點。LC/MS或LC-MS或LCMS意指液相層析法質譜法，並且裝置和方法的描述如下。

【0280】 在Bruker 400MHz波譜儀上記錄<sup>1</sup>H NMR和<sup>19</sup>F NMR測量值，化學位移相對於TMS（<sup>1</sup>H）和CFCl<sub>3</sub>（<sup>19</sup>F）標準品以ppm給出。光譜在如指定的氘代溶劑中測量。用以下LCMS方法中的任一種來表徵該等化合物。對於每種化合物獲得的特徵LCMS值係保留時間（「Rt」，以分鐘記錄）和測量的分子離子(M+H)<sup>+</sup>或(M-H)<sup>-</sup>。

【0281】 **LCMS方法A:**在來自沃特斯公司(Waters Corp.)的質譜儀(SQD、

SQDII或QDA單四極桿質譜儀)上記錄光譜,該質譜儀裝備有電灑源(極性:正離子和負離子),毛細管:0.8-3.00 kV,錐孔:5-30 V,源溫度:120°C-150°C,去溶劑化溫度:350°C-600°C,錐孔氣體流量:50-150 l/h,去溶劑化氣體流量:650-1000 l/h,質量範圍:50至900 Da,和來自沃特斯公司的Acquity UPLC:二元泵、經加熱的管柱室、二極體陣列檢測器和ELSD。管柱:Waters UPLC HSS T3, 1.8 μm, 30 x 2.1 mm,溫度:60°C,DAD波長範圍(nm):210至400,執行時間:1.5 min;溶劑:A=水+5%MeOH+0.05%HCOOH,B=乙腈+0.05%HCOOH;流量(ml/min)0.85,梯度:10%B等度持續0.2 min,然後在1.0 min內10%-100%B,100%B等度持續0.2 min,在0.05 min內100%-10%B,10%B等度持續0.05 min。

**【0282】 LCMS方法B:**在來自沃特斯公司的質譜儀(SQD,SQDII或QDA單四極桿質譜儀)上記錄光譜,該質譜儀裝備有電灑源。

優化的質量參數:離子化方法:電灑(ESI),極性:正和負極性轉換,掃描類型:全掃描,毛細管(kV):0.8,錐孔電壓(V):23,源溫度(°C):120,去溶劑化氣體流量(L/Hr):1000,去溶劑化溫度(°C):600,錐孔氣體流量(L/Hr):50,質量範圍:110至1200 Da;

梯度條件:溶劑A:含0.1%甲酸的水:乙腈:95:5 v/v,溶劑B:含0.05%甲酸的乙腈

時間(分鐘) A (%) B (%) 流速(ml/min)

0.9	0	10	0.6
0.2	90	10	0.6
0.3	50	50	0.6
0.6	0	100	0.6
1.3	0	100	0.6
1.4	90	10	0.6

1.6                    90            10                    0.6

PDA波長範圍：200至400 nm

管柱：Acquity UPLC HSS T3 C18，管柱長：30 mm，管柱內徑：2.1 mm，  
粒度：1.8 μ，管柱溫箱溫度：40°C。

**【0283】 LCMS方法C**：在來自沃特斯公司的質譜儀（SQD，SQDII或QDA單四極桿質譜儀）上記錄光譜，該質譜儀裝備有電灑源。

優化的質量參數：離子化方法：電灑（ESI）；極性：正和負極性轉換；掃描類型：全掃描；毛細管（kV）：3.00；錐孔電壓（V）：41.00；源溫度（°C）：150；去溶劑化氣體流量（L/Hr）：1000；去溶劑化溫度（°C）：500；錐孔氣體流量（L/Hr）：50；質量範圍：110至1000 Da

梯度條件：溶劑A：含0.1%甲酸的水：乙腈：95：5 v/v；**溶劑B**：含0.05%甲酸的乙腈

時間（分鐘） A（%） B（%） 流速（ml/min）

0	90	10	0.6
0.2	90	10	0.6
0.3	50	50	0.6
0.6	0	100	0.6
1.3	0	100	0.6
1.4	90	10	0.6
1.6	90	10	0.6

PDA波長範圍：200至400 nm；

管柱：Acquity UPLC HSS T3 C18；管柱長：30 mm；管柱內徑：2.1 mm；  
粒度：1.8 μ；管柱烘箱溫度：40°C。

**【0284】 LCMS方法D**：在來自安捷倫科技公司（Agilent Technologies）的

6410三重四極質譜儀（HPLC：安捷倫1200系列HPLC）上記錄光譜

優化的質量參數：離子化方法：電灑（ESI）；極性：正和負極性轉換；掃描類型：MS2掃描；毛細管（kV）：4.00；碎裂電壓（Fragmentor）（V）：100.00；氣體溫度（°C）：350；氣體流量（L/min）：11；噴霧器氣體（psi）：40；質量範圍：110至1000 Da；檢測（VWD）：254 nm。

梯度條件：溶劑A：含0.1%甲酸的水：乙腈：95：5 v/v；溶劑B：含0.1%甲酸的乙腈

時間（分鐘）	A（%）	B（%）	流速（ml/min）
0	90	10	1.8
0.9	0	100	1.8
1.8	0	100	1.8
2.2	90	10	1.8
2.5	90	10	1.8

管柱：KINETEX EVO C18；管柱長：50 mm；管柱內徑：4.6 mm；粒度：2.6 μ；管柱烘箱溫度：40°C

**【0285】 LCMS方法E**：在來自沃特斯公司的質譜儀（Acquity QDa質譜儀）上記錄光譜，該質譜儀裝備有電灑源（極性：正和負極性轉換），毛細管：0.8 kV，錐孔範圍：25 V，萃取器：V（Qda檢測器無萃取器電壓），源溫度：120°C，去溶劑化溫度：600°C，錐孔氣體流量：50 L/h，去溶劑化氣體流量：1000 L/h，質量範圍：110至850 Da）和來自沃特斯公司的Acquity UPLC：四元溶劑管理器，加熱管柱室，二極體陣列檢測器。管柱：Acquity UPLC HSS T3 C18，1.8 μm，30 x 2.1 mm，溫度：40°C，DAD波長範圍（nm）：200至400，溶劑梯度：A = 水 + 5%乙腈 + 0.1% HCOOH，B = 乙腈 + 0.05% HCOOH；梯度：0 min 10% B；0.0-0.2 min 10%-50% B；0.2-0.6 min 50-100% B；0.6-1.3 min 100% B；1.3-1.4 min



100-10% B ; 1.4-1.6 min 10% B ; 流量 (mL/min) 0.6 。

**【0286】 LCMS方法F**：在來自沃特斯公司的ACQUITY質譜儀 (SQD或SQDII單四極桿質譜儀) 上記錄光譜，該質譜儀裝備有電灑源 (極性：正離子或負離子，毛細管：3.0 kV，錐孔：30 V，萃取器：3.00 V，源溫度：150°C，去溶劑化溫度：400°C，錐孔氣體流量：60 L/hr，去溶劑化氣體流量：700 L/hr，質量範圍：140至800 Da) 和來自沃特斯公司的ACQUITY UPLC，其具有溶劑脫氣裝置、二元泵、經加熱的管柱室以及二極體陣列檢測器。管柱：Waters UPLC HSS T3，1.8 μm，30 x 2.1 mm，溫度：60°C，DAD波長範圍 (nm)：210至400，溶劑梯度：A = 水/甲醇9:1 + 0.1%甲酸，B = 乙腈 + 0.1%甲酸，梯度：0%-100% B，在3.0 min內；流量 (ml/min) 0.75 。

#### 配製物實施例

可濕性粉劑	a)	b)	c)
活性成分	25%	50%	75%
木質素磺酸鈉	5%	5%	-
月桂基硫酸鈉	3%	-	5%
二異丁基萘磺酸鈉	-	6%	10%
苯酚聚乙二醇醚 (7-8 mol的環氧乙烷)	-	2%	-
高度分散的矽酸	5%	10%	10%
高嶺土	62%	27%	-

將該組合與該等助劑充分混合並且將混合物在適合的研磨機中充分研磨，從而獲得了可以用水稀釋以得到所希望的濃度的懸浮液的可濕性粉劑。

乾種子處理用的粉劑	a)	b)	c)
活性成分	25%	50%	75%
輕質礦物油	5%	5%	5%

高度分散的矽酸	5%	5%	-
高嶺土	65%	40%	-
滑石	-	-	20%

將該組合與該等助劑充分混合並且將混合物在適合的研磨機中充分研磨，從而獲得可以直接用於種子處理的粉劑。

#### 可乳化濃縮物

活性成分	10%
辛基酚聚乙二醇醚（4-5 mol的環氧乙烷）	3%
十二烷基苯磺酸鈣	3%
蓖麻油聚乙二醇醚（35 mol的環氧乙烷）	4%
環己酮	30%
二甲苯混合物	50%

在植物保護中可以使用的具有任何所要求的稀釋度的乳液可以藉由用水稀釋從這種濃縮物中獲得。

塵粉劑	a)	b)	c)
活性成分	5%	6%	4%
滑石	95%	-	-
高嶺土	-	94%	-
礦物填料	-	-	96%

藉由將該組合與載體混合並且將混合物在適合的研磨機中研磨而獲得即用型塵粉劑。此類粉劑還可以用於種子的乾拌種。

#### 擠出機顆粒劑

活性成分	15%
木質素磺酸鈉	2%

羧甲基纖維素	1%
高嶺土	82%

將該組合與該等助劑混合並且研磨，並且將混合物用水濕潤。將混合物擠出並且然後在空氣流中乾燥。

#### 包衣的顆粒劑

活性成分	8%
聚乙二醇（分子量200）	3%
高嶺土	89%

將該精細研磨的組合在混合器中均勻地施用於用聚乙二醇濕潤的高嶺土中。以此方式獲得無塵的包衣的顆粒劑。

#### 懸浮液濃縮物

活性成分	40%
丙二醇	10%
壬基酚聚乙二醇醚（15 mol的環氧乙烷）	6%
木質素磺酸鈉	10%
羧甲基纖維素	1%
矽酮油（以在水中75%乳液的形式）	1%
水	32%

將該精細研磨的組合與該等助劑緊密地混合，得到懸浮液濃縮物，從該懸浮液濃縮物可以藉由用水稀釋獲得任何所希望的稀釋度的懸浮液。使用此類稀釋物，可以藉由噴霧、澆灌或浸漬對活的植物連同植物繁殖材料進行處理並且對其針對微生物侵染進行保護。

#### 種子處理用的可流動性濃縮物

活性成分	40%
------	-----

丙二醇	5%
共聚物丁醇PO/EO	2%
三苯乙烯酚，具有10-20莫耳EO	2%
1,2-苯并異噻唑啉-3-酮（以在水中20%溶液的形式）	0.5%
單偶氮-顏料鈣鹽	5%
矽酮油（以在水中75%乳液的形式）	0.2%
水	45.3%

將該精細研磨的組合與該等助劑緊密地混合，得到懸浮液濃縮物，從該懸浮液濃縮物可以藉由用水稀釋獲得任何所希望的稀釋度的懸浮液。使用此類稀釋物，可以藉由噴霧、澆灌或浸漬對活的植物連同植物繁殖材料進行處理並且對其針對微生物侵染進行保護。

#### 緩釋的膠囊懸浮液

**【0287】** 將28份的組合與2份的芳香族溶劑以及7份的甲苯二異氰酸酯/聚甲烯(polymethylene)-聚苯基異氰酸酯-混合物(8:1)進行混合。將此混合物在1.2份的聚乙烯醇、0.05份的消泡劑以及51.6份的水的混合物中進行乳化直至達到所希望的粒度。向此乳液中添加在5.3份的水中的2.8份的1,6-己二胺混合物。將混合物攪拌直至聚合反應完成。將獲得的膠囊懸浮液藉由添加0.25份的增稠劑以及3份的分散劑進行穩定。該膠囊懸浮液配製物含有28%的活性成分。介質膠囊的直徑係8-15微米。將所得配製物作為適用於此目的裝置中的水性懸浮液施用到種子上。

**【0288】** 配製物類型包括乳液濃縮物( EC)、懸浮液濃縮物( SC)、懸乳液( SE)、膠囊懸浮液( CS)、水可分散性顆粒劑( WG)、可乳化的顆粒劑( EG)、油包水型乳液( EO)、水包油型乳液( EW)、微乳液( ME)、油分散體( OD)、油懸劑( OF)、油溶性液劑( OL)、可溶性濃縮物( SL)、超低容量懸浮液( SU)、

超低容量液劑 (UL)、母藥 (TK)、可分散性濃縮物 (DC)、可濕性粉劑 (WP)、可溶性顆粒劑 (SG) 或與農業上可接受的佐劑組合的任何技術上可行的配製物。

### 縮寫

$\text{CDCl}_3$  氘代氯仿

conc. 濃 (concentrated)

DABCO 1,4-二氮雜雙環[2.2.2]辛烷，也稱為三伸乙二胺或TEDA

DCC 二環己基碳二亞胺

DIPEA 二異丙基乙胺 (N,N-二異丙基乙胺)

DMF 二甲基甲醯胺 (N,N-二甲基甲醯胺)

DMSO 二甲基亞砜

DMSO-d6 氘代二甲基亞砜

EDC 1-乙基-3-(3-二甲基胺基丙基)碳二亞胺

equiv. 當量

$\text{Et}_3\text{N}$  三乙胺

EtOAc 乙酸乙酯

HATU 1-[雙(二甲基胺基)亞甲基]-1H-1,2,3-三唑并[4,5-b]吡啶鎘3-氧化

物六氟磷酸鹽

HCl 鹽酸

h/hrs 小時

LCMS 液相層析法質譜法

M 體積莫耳濃度

N 正常

rh 相對濕度

rt 室溫

RT	保留時間
ssp.	亞種
TBME	甲基三級丁基醚或三級丁基甲基醚
THF	四氫呋喃
TLC	薄層層析法
TMS	四甲基矽烷
T3P	丙基膦酸酐，反應性正丙基膦酸環狀酸酐

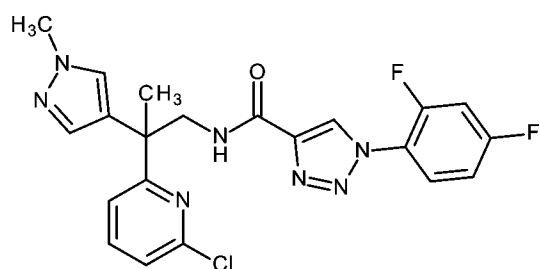
### 製備實施例：

根據本發明之具有式 (I) 的化合物可以使用以上和以下所述之合成技術製備。

「Mp」意指以°C（攝氏度）計的熔點。自由基表示甲基。

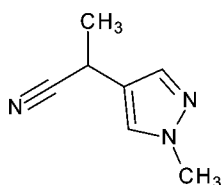
在Bruker 400MHz波譜儀上記錄<sup>1</sup>H NMR和<sup>19</sup>F NMR測量值，化學位移相對於TMS (<sup>1</sup>H)和CFCl<sub>3</sub> (<sup>19</sup>F)標準品以ppm給出。光譜在如指定的氘代溶劑中測量。用以下LCMS方法中的任一種來表徵該等化合物。對於每種化合物獲得的特徵LCMS值係保留時間（「Rt」，以分鐘記錄）和測量的分子離子(M+H)<sup>+</sup>或(M-H)<sup>-</sup>。

**【0289】 實施例1：** N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-1-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺（化合物P-1，表P）的製備



（化合物P-1，表P）

**【0290】 步驟1：** 2-(1-甲基吡啶-4-基)丙腈的製備

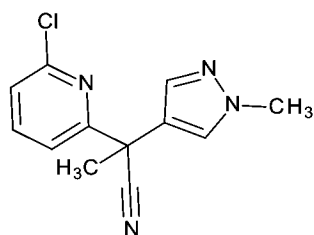


在氬氣下將2-(1-甲基-1h-吡唑-4-基)乙腈 (10.00 g, 78.42 mmol) 溶解在THF (314 mL) 中，並將淡黃色溶液冷卻至 $-78^{\circ}\text{C}$ 。向此溶液中逐滴添加正丁基鋰 (31 mL, 78.42 mmol)，並將所得的淡棕色懸浮液在此溫度下攪拌25分鐘。在此時間之後，逐滴添加碘甲烷 (11.24 g, 4.93 mL, 78.42 mmol)。將所得的棕色溶液在 $-78^{\circ}\text{C}$ 下攪拌5分鐘，使其升溫至室溫 (rt) 並在rt下在氬氣下攪拌30分鐘。將反應混合物倒入水中，並且然後用EtOAc萃取兩次。將合併的有機層用鹽水洗滌一次，經無水硫酸鈉乾燥，過濾並在真空中濃縮以得到呈淺棕色液體的2-(1-甲基吡唑-4-基)丙腈。

LC/MS (方法A) ; 136  $[\text{M}+\text{H}]^+$  ; 保留時間 : 0.43 min , 0.44 min , 0.55 min 。

$^1\text{H}$  NMR (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm 1.64 (d,  $J = 6.90$  Hz, 3 H) 3.86 - 3.93 (m, 4 H) 7.40 (s, 1 H) 7.46 (s, 1 H) 。

**【0291】 步驟2：2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙腈的製備**



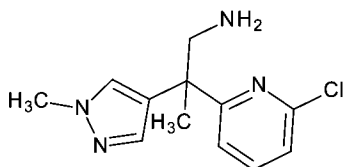
在氬氣下，將2-(1-甲基吡唑-4-基)丙腈樣品 (2.00 g, 14.80 mmol) 溶解在THF (59.18 mL) 中以得到淡黃色溶液。將溶液冷卻至 $-78^{\circ}\text{C}$ ，並且然後用正丁基鋰 (5.90 mL, 14.80 mmol) 逐滴地處理。在分批添加2,6-二氯吡啶 (2.23 g, 14.80 mmol) 之前，將所得的淡棕色懸浮液在此溫度下攪拌10分鐘。將所得的棕色懸浮液在 $-78^{\circ}\text{C}$ 下攪拌5分鐘，使其達到室溫並在氬氣下在rt下攪拌30分鐘以得到淺棕色溶液。將反應混合物倒入水中並且用乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機層用鹽水洗滌一次，經無水硫酸鈉乾燥，過濾並在 $60^{\circ}\text{C}$ 下在真空中濃縮以得到3.68 g 的深棕色液體。將粗棕色液體用在環己烷中的乙酸乙酯洗提液藉由急速層析法來純化以產生呈淡黃色油狀物的2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙腈

(2.71 g, 74.2產率)。

LC/MS (方法A) ; 247 [M+H]<sup>+</sup> ; 保留時間 : 0.82 min 。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm 2.12 (s, 3 H) 3.90 (s, 3 H) 7.27 - 7.32 (m, 1 H) 7.45 (s, 1 H) 7.46 - 7.54 (m, 2 H) 7.62 - 7.74 (m, 1 H) 。

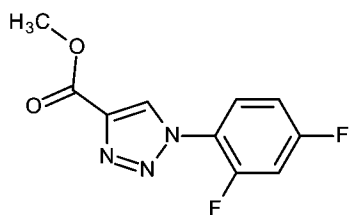
**【0292】 步驟3 :** 2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙-1-胺的製備



在室溫下在氫氣下，將2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙腈 (2.71 g, 11.0 mmol) 在THF (33.0 mL) 中的溶液用硼烷二甲硫醚錯合物 (2.50 g, 3.13 mL, 33.0 mmol) 逐滴地處理，並且將所得的淡黃色溶液在65°C下攪拌4小時。在逐滴添加濃鹽酸 (HCl) (7.36 mL, 44.2 mmol) 之前，將反應混合物冷卻至0°C。將反應混合物在50°C下攪拌1小時。將反應混合物冷卻至rt並添加水。向此反應混合物中添加氫氧化鈉 (6N NaOH) 水溶液直到pH為12，並將所得的反應混合物用乙酸乙酯萃取三次。將合併的有機層用鹽水洗滌一次，經無水硫酸鈉乾燥，並且在真空中濃縮以得到呈淡黃色油狀物的2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙-1-胺，其不經進一步純化而可以用於下一步驟中。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO d<sub>6</sub>) δ ppm 1.57 (s, 3 H) 2.98 (d, *J* = 12.72 Hz, 1 H) 3.16 (d, *J* = 12.72 Hz, 1 H) 3.77 (s, 3 H) 7.20 - 7.35 (m, 3 H) 7.50 (s, 1 H) 7.75 (t, *J* = 7.81 Hz, 1 H) 。

**【0293】 步驟4 :** 1-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲酸甲酯的製備



將1-疊氨基-2,4-二氟-苯 (0.30 g, 1.8 mmol) 在甲醇 (3.6 mL) 中的溶液依

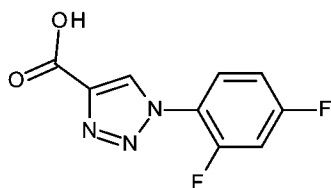


次用無水硫酸銅(II) (0.053 g, 0.33 mmol)、水 (3.6 mL) 中的抗壞血酸鈉 (0.46 g, 2.3 mmol)、以及然後丙-2-炔酸甲酯 (0.14 g, 0.14 mL, 1.7 mmol) 處理。將帶紅色的反應混合物在rt下攪拌2天 (藉由LCMS監測)。然後將反應混合物在真空中濃縮，並將殘餘物吸收於水和EtOAc中。將有機層分離，用鹽水洗滌，並將分離的有機層經MgSO<sub>4</sub>乾燥，過濾並在真空中濃縮。將粗產物吸附到ISOLUTE®上並經矽膠管柱 (Rf200) 純化，用環己烷/EtOAc洗提，以得到呈白色固體的標題化合物。

LC/MS (方法A) m/z = 240 [M+H]<sup>+</sup>; 保留時間 = 0.79 min;

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm 4.02 (s, 3 H) 7.09 - 7.17 (m, 2 H) 7.96 - 8.05 (m, 1 H) 8.59 (d, *J* = 2.57 Hz, 1 H)

**【0294】 步驟5：1-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲酸的製備**



在氫氣下將1-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲酸甲酯 (0.31 g, 1.3 mmol) 溶解在THF (6.5 mL) 和水 (3.2 mL) 中以得到淡棕色溶液。向此溶液中添加LiOH·H<sub>2</sub>O (0.047 g, 1.9 mmol) 並將混合物在rt下攪拌。3小時後，LC/MS分析 (rt = 0.63 min時的所希望質量) 顯示起始材料的完全消耗。將樣品在真空中濃縮並將殘餘物吸收於水和EtOAc中，並將所得的混合物用2N HCl酸化。將有機層分離，經Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>乾燥，過濾並在真空中濃縮以得到呈白色固體的標題化合物。

LC/MS (方法A) : m/z = 226 [M+H]<sup>+</sup>; 保留時間 = 0.63 min;

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO) δ ppm 7.27 - 7.52 (m, 1 H) 7.73 (ddd, *J* = 11.10, 8.71, 2.57 Hz, 1 H) 7.95 (td, *J* = 8.80, 5.87 Hz, 1 H) 9.15 (d, *J* = 1.47 Hz, 1 H) 13.26 - 13.60 (m, 1 H)

**【0295】 步驟6：N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-1-(2,4-二**  
第125頁，共 143 頁(發明說明書)

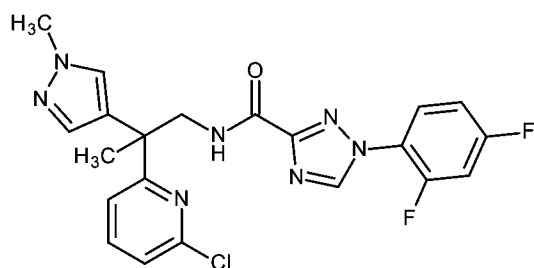
氟苯基)三唑-4-甲醯胺 (化合物P-1, 表P) 的製備

將1-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲酸 (0.225 g, 1.0 mmol) 和2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙-1-胺 (0.25 g, 1 mmol) 懸浮於EtOAc (6 mL) 中。在0°C下向此混合物中添加二異丙基乙胺 (DIPEA) (0.65 g, 5 mmol) 和1-丙烷膦酸酐 (T3P, 在EtOAc中50質量%, 2 mL), 並將反應混合物在rt下攪拌2小時 (LCMS 分析顯示反應完成)。將反應混合物用水稀釋並將所得的混合物用EtOAc (2 x 20 mL) 萃取。將合併的有機層用鹽水洗滌, 經Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>乾燥並在真空中濃縮。將粗產物吸附在矽膠上並藉由用0-80% 環己烷/EtOAc 洗提的組合閃式層析法 (combiflash) 來純化以得到呈白色固體的標題化合物。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm 8.50 (d, *J* = 2.57 Hz, 1 H) 8.05 (br t, *J* = 6.36 Hz, 1 H) 7.91 (td, *J* = 8.71, 5.69 Hz, 1 H) 7.58 (t, *J* = 7.82 Hz, 1 H) 7.35 (s, 1 H) 7.29 (s, 1 H) 7.23 (d, *J* = 7.82 Hz, 1 H) 7.12 (dd, *J* = 8.86, 8.01 Hz, 2 H) 7.06 - 7.10 (m, 1 H) 4.11 (dd, *J* = 16.75, 6.60 Hz, 2 H) 3.88 (s, 3 H) 1.74 (s, 3 H);

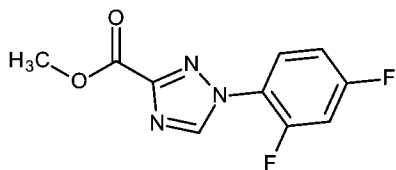
LC/MS (方法B): *m/z* = 458 [M+H]<sup>+</sup>; 保留時間 = 1.09 min

**【0296】 實施例2:** N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-1-(2,4-二氟苯基)-1,2,4-三唑-3-甲醯胺 (化合物P-4, 表P) 的製備。



(化合物P-4, 表P)

**步驟1:** 1-(2,4-二氟苯基)-1,2,4-三唑-3-甲酸甲酯的製備



類似於*Org. Lett. [有機化學通訊]* **2018**, *20*, 6930-6933中所述之製備。因此,

將2,4-二氟苯重氮四氟硼酸鹽（如*J. Am. Chem. Soc. [美國化學會誌] (1956), 78, 2593-6*中所述之製備，500 mg，0.5 g，2.1939 mmol）在THF（8.8 mL）中的溶液冷卻至0°C，並在0°C下添加乙酸鋰二水合物（0.44765 g，4.3879 mmol）、Cu(OAc)<sub>2</sub>（0.10當量，0.03985 g，0.21939 mmol）和2-異氰基乙酸甲酯（1.20當量，0.2609 g，0.239 mL，2.6327 mmol），並將混合物在此溫度下攪拌4小時。LCMS分析顯示在此時間之後反應完成。將反應混合物倒入水（25 mL）中並將所得的混合物用EtOAc（2 X 20 mL）萃取。將合併的有機層用鹽水洗滌，經Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>乾燥並在真空中濃縮。將粗材料藉由管柱層析法（24 g SiO<sub>2</sub>管柱，用EtOAc/環己烷梯度洗提）純化以得到呈油狀物的標題化合物。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm 8.68 (d, J = 2.81 Hz, 1 H) 7.93 - 8.00 (m, 1 H) 7.08 - 7.14 (m, 2 H) 4.08 (s, 3 H) 1.27 (s, 1 H)

**步驟2：** N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-1-(2,4-二氟苯基)-1,2,4-三唑-3-甲醯胺（化合物P-4，表P）的製備

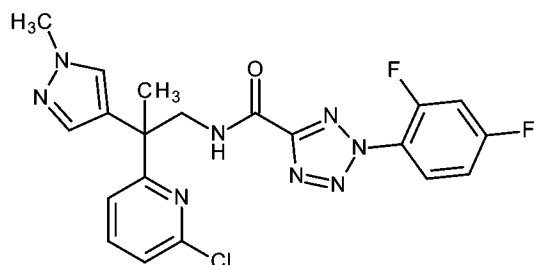
將2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙-1-胺（0.031 g，0.12 mmol）添加到微波小瓶中的1-(2,4-二氟苯基)-1,2,4-三唑-3-甲酸甲酯（0.025 g，0.10 mmol）在甲苯（0.75 mL）中的溶液中。將此反應混合物在氬氣氣氛下攪拌5分鐘並且然後添加雙(三甲基鋁)-1,4-二氮雜雙環[2.2.2]辛烷加合物（0.041 g，0.16 mmol），並將所得的反應混合物在70°C下在微波中攪拌。反應完成後，將反應混合物用水稀釋，用EtOAc萃取，並且將有機層用鹽水洗滌，經Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>乾燥並在真空中濃縮。將得到的粗殘餘物藉由使用環己烷/乙酸乙酯洗提液系統的矽膠層析法來純化，以得到呈黏性塊狀物的N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-1-(2,4-二氟苯基)-1,2,4-三唑-3-甲醯胺。

LCMS（方法C）：458 [M+H]<sup>+</sup>；保留時間 = 1.03 min；

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm 8.52 (d, 1 H), 8.27 (br t, 1 H), 7.94 (td, 1 H),

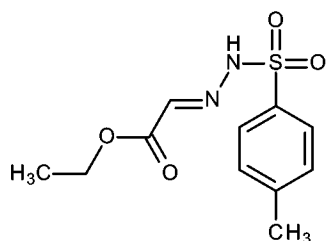
7.51 (t, 1 H), 7.23 - 7.20 (m, 2 H), 7.14-7.18 (m, 1 H), 6.98 - 7.10 (m, 3 H), 4.01 (dd, 2 H), 3.80 (s, 3 H), 1.66 (s, 3H)

**【0297】 實施例3**：*N*-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲醯胺（化合物P-6，表P）的製備



（化合物P-6，表P）。

**步驟1**：(2E)-2-(對甲苯磺醯基亞肼基)乙酸乙酯的製備

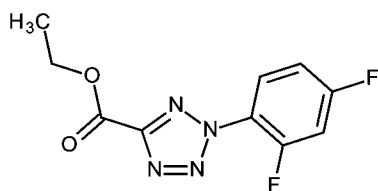


在室溫下，將4-甲基苯磺醯肼（CAS [1576-35-8]，2 g，10.73 mmol）在乙醇（40 mL）中的溶液用2-側氧基乙酸乙酯（2.63 g，12.88 mmol）處理。將反應混合物攪拌1小時並藉由在真空中濃縮除去乙醇。將獲得的殘餘物用水稀釋並且用EtOAc萃取。分離有機相，並在真空中蒸發溶劑以得到(2E)-2-(對甲苯磺醯基亞肼基)乙酸乙酯，將其按原樣用於下一步驟（步驟2）中。

LCMS（方法C）：271 [M+H]<sup>+</sup>；保留時間 = 1.04 min；

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm 9.31 (s, 1 H) 7.85 (d, *J* = 8.31 Hz, 2 H) 7.34 (d, *J* = 8.07 Hz, 2 H) 7.23 (s, 1 H) 4.27 (q, *J* = 7.09 Hz, 2 H) 4.14 (q, *J* = 7.09 Hz, 1 H) 2.44 (s, 3 H) 2.07 (s, 2 H) 1.23 - 1.37 (m, 7 H)。

**步驟2**：2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲酸乙酯的製備

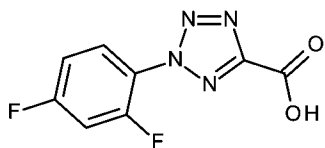


將2,4-二氟苯胺 (1 g, 7.74 mmol) 溶解在6M鹽酸水溶液 (去離子水) (6 mL, 36 mmol) 和乙醇 (5 mL) 中並冷卻至0°C。向該溶液中添加亞硝酸鈉 (0.64 g, 9.29 mmol) 並將所得的溶液在0°C下攪拌1小時，並且然後在-20°C下逐滴添加到 (2E)-2-(對甲苯磺酰基亞胛基)乙酸乙酯 (2.3 g, 8.51 mmol) 在吡啶 (20 mL) 中的溶液中。允許反應混合物緩慢升溫至室溫並且然後攪拌5小時。將所得的混合物用1N HCl稀釋並將水層用EtOAc (3 x 20 mL) 萃取。將合併的有機層經Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 乾燥並在真空中濃縮以得到粗產物，將其藉由用己烷中的30% EtOAc洗提的管柱層析法來純化以得到呈帶紅色的油狀物的2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲酸乙酯。

LCMS (方法B): [M+H]<sup>+</sup>未檢測; 保留時間 = 1.10 min;

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm 7.86 - 7.94 (m, 1 H) 7.11 - 7.21 (m, 2 H) 4.60 (q, J = 7.21 Hz, 2 H) 2.03 (s, 1 H) 1.51 (t, J = 7.13 Hz, 3 H)

### 步驟3: 2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲酸的製備



在rt下向攪拌的5-甲基異噁唑-3-甲酸甲酯 (300 mg, 1.18 mmol) 在THF (3 mL) 和水 (1.5 mL) 中的溶液中添加LiOH·H<sub>2</sub>O (0.113 mg, 4.72), 並將反應混合物在室溫下攪拌30 min。將有機溶劑藉由在真空中濃縮除去，並將水性殘餘物用2N HCl稀釋，並且然後用EtOAc (3 x 20 mL) 萃取。將合併的有機相經Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 乾燥，過濾並在真空中濃縮以得到帶紅色的固體2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲酸。

LCMS (方法C): 227 [M+H]<sup>+</sup>; 保留時間 = 0.87-1.11 min;

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ ppm 8.10 (td, J = 8.69, 5.75 Hz, 1 H) 7.73 -

7.88 (m, 1 H) 7.40 - 7.50 (m, 1 H) 3.36 - 3.63 (m, 3 H) 3.07 - 3.35 (m, 3 H) 1.99 (s, 1 H) 1.91 (s, 1 H) 1.24 (s, 1 H)

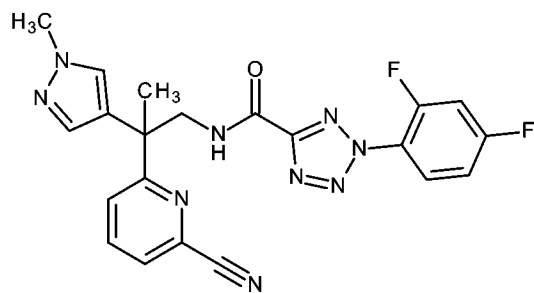
**步驟4：** *N*-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲醯胺（化合物P-6，表X）的製備。

將2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙-1-胺（6.37 g，22.9 mmol，如先前所述之製備）、2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲酸（6.32 g，25.2 mmol）、*N,N*-二異丙基乙胺（DIPEA）（9.33 g，68.6 mmol）和T3P（在EtOAc中50質量%）（40 mL）的混合物在室溫下在EtOAc（114 mL）中攪拌1小時。LCMS顯示在此時間之後反應完成。將反應混合物用水和EtOAc稀釋，將有機層分離並將水層用EtOAc反萃取三次。將合併的有機層經Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>乾燥，過濾並在真空中蒸發。將粗產物藉由用EtOAc/環己烷洗提的管柱層析法來純化以得到呈灰白色固體的*N*-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲醯胺。

LCMS（方法B）：459 [M+H]<sup>+</sup>；保留時間 = 1.14 min；

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm 8.75 (t, *J* = 6.38 Hz, 1 H), 8.07 (td, *J* = 8.76, 5.75 Hz, 1 H), 7.76 - 7.83 (m, 2 H), 7.62 (s, 1 H), 7.45 (t, *J* = 8.38 Hz, 1 H), 7.38 (d, *J* = 7.38 Hz, 1 H), 7.35 (d, *J* = 0.75 Hz, 1 H), 7.29 (d, *J* = 7.25 Hz, 1 H), 4.08 (dd, *J* = 13.26, 6.25 Hz, 1 H), 3.91 (dd, *J* = 13.32, 6.57 Hz, 1 H), 3.78 (s, 3 H), 1.66 (s, 3 H)

**【0298】 實施例4：** *N*-[2-(6-氯基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲醯胺（化合物P-5，表P）的製備。



（化合物P-5，表P）。

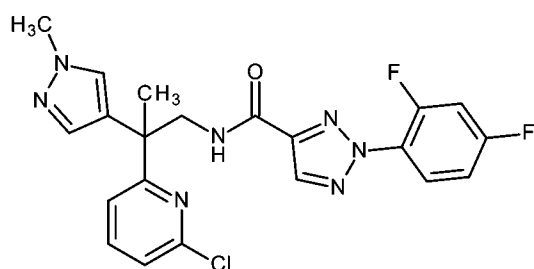
在氮氣氣氛下，將*N*-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-2-(2,4-二

氟苯基)四唑-5-甲醯胺 (2.40 g, 4.97 mmol, 如實施例3中所述之製備) 和氰化鋅 (1.19 g, 9.94 mmol) 溶解在 *N,N*-二甲基甲醯胺 (25 mL) 中。將所得的反應混合物在氮氣下脫氣10分鐘。然後，添加四(三苯基膦)鈾(0) (0.58 g, 0.49 mmol)，並且將所得的淡棕色懸浮液在120°C下在微波中攪拌2小時。藉由LCMS監測反應進程。反應完成後，將反應混合物用水稀釋並用EtOAc萃取。將有機層經Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>乾燥並在真空中濃縮。將粗化合物藉由使用EtOAc/環己烷作為洗提液的組合閃式層析法來純化。將所得的化合物藉由使用水中的乙腈作為洗提液的反相管柱進一步純化以得到呈白色固體的 *N*-[2-(6-氟基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲醯胺。

LCMS (方法B) : 450 [M+H]<sup>+</sup> ; 保留時間 = 0.95 min ;

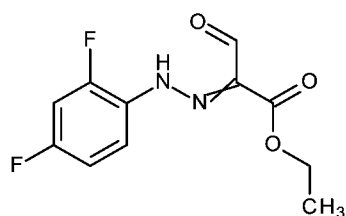
<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm 8.80 (t, J = 6.30 Hz, 1 H), 8.07 (td, J = 8.74, 5.75 Hz, 1 H), 7.90 - 7.99 (m, 2 H), 7.80 (ddd, J = 11.10, 8.83, 2.69 Hz, 1 H), 7.64 (s, 1 H), 7.63 (d, J = 8.34 Hz, 1 H), 7.42 - 7.48 (m, 1 H), 7.36 (d, J = 0.73 Hz, 1 H), 4.13 (dd, J = 13.33, 6.24 Hz, 1 H), 3.94 (dd, J = 13.39, 6.66 Hz, 1 H), 3.78 (s, 3 H), 1.69 (s, 3 H)。

**【0299】 實施例5** : *N*-[2-(6-氟-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺 (化合物P-3, 表P) 的製備。



(化合物P-3, 表P)。

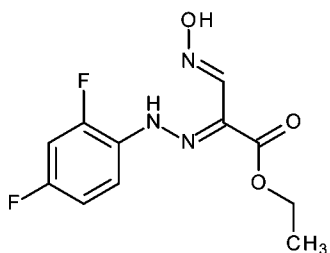
**步驟1** : 2-[(2,4-二氟苯基)亞肼基]-3-側氧基-丙酸乙酯的製備



在室溫下，向裝備有氮氣入口的兩頸圓底燒瓶中添加水（32 mL）中的2,4-二氟苯胺（4.00 g，30.9 mmol）和濃HCl（12 mL，35%）。將反應混合物冷卻至0°C並向此溶液中添加亞硝酸鈉（2.56 g，37.1 mmol）在水（32 mL）中的冷溶液，並將所得的混合物在0°C下攪拌5 min。在另一個圓底燒瓶中，攪拌3-(二甲基胺基)丙-2-烯酸乙酯（12.0 g，23.4 mmol）和乙酸鉀（4.61 g，46.4 mmol）在乙醇（40 mL）中的溶液並冷卻至0°C。在0°C下，向其中逐滴添加上述重氮化溶液，並允許反應混合物升溫至室溫並攪拌18小時。LCMS顯示形成了所希望的產物。將反應用水稀釋並且用EtOAc（3 x 50 mL）萃取。將合併的有機層用鹽水洗滌，經Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>乾燥並在真空中濃縮以得到呈棕色固體的粗2-[(2,4-二氟苯基)亞肼基]-3-側氧基-丙酸乙酯，將其按原樣用於下一步驟中。

LCMS（方法B）：257 [M+H]<sup>+</sup>；保留時間 = 1.09 min

### 步驟2：2-[(2,4-二氟苯基)亞肼基]-3-肼基-丙酸乙酯的製備

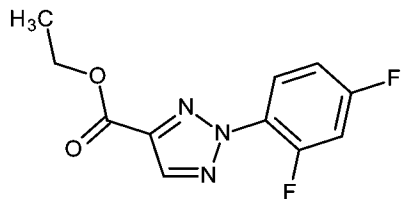


向2-[(2,4-二氟苯基)亞肼基]-3-側氧基-丙酸乙酯（3.00 g，5.85 mmol）在乙醇（30 mL）中的溶液中添加乙酸鉀（1.45 g，14.6 mmol）和脛胺鹽酸鹽（0.49 g，7.02 mmol）。將反應混合物在80°C下攪拌2 h。LCMS顯示完全轉化為所希望的產物。將反應混合物冷卻至rt並用水稀釋並用EtOAc（3 x 50 mL）萃取。將合併的有機層用鹽水洗滌，經Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>乾燥，並在真空中濃縮以得到呈棕色固體的標題化合物，將其按原樣用於下一步驟中。



LCMS (方法B): 272 [M+H]<sup>+</sup>; 保留時間 = 1.16 min;

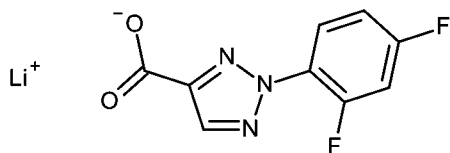
**步驟3**: 2-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲酸乙酯的製備



在室溫下，將2-[(2,4-二氟苯基)亞肼基]-3-肼基-丙酸乙酯 (3.4 g, 6.3 mmol) 用乙酸酐 (34 mL, 10 mL/g) 處理。然後將反應混合物在140°C下攪拌1 h。藉由 LC-MS 監測反應並且完成後將反應混合物冷卻並用冰冷的鹽水淬滅。將反應混合物用 EtOAc (3 x 25 mL) 萃取，並將合併的有機層經 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 乾燥，並在真空中濃縮，以產生粗產物。將其藉由使用 EtOAc/環己烷作為洗提液 (5:95) 的組合閃式層析法來純化以得到呈棕色固體的標題化合物。

LCMS (方法C): 254 [M+H]<sup>+</sup>; 保留時間 = 1.19 min

**步驟4**: 2-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲酸鋰的製備



向攪拌的2-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲酸乙酯 (0.10 g, 0.31 mmol) 在 THF (0.4 mL) 和水 (0.1 mL) 中的溶液中添加氫氧化鋰 (11.0 mg 0.47 mmol)，並將反應在rt室溫下攪拌3小時。反應完成後，將反應混合物在真空中濃縮，並將殘餘物用甲基三級丁基甲基醚 (TBME) 研磨。這產生了2-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲酸鋰，將其按原樣用於下一步驟中。

LCMS (方法B): 224 [M+H]<sup>+</sup>; 保留時間 = 0.29 min

**步驟5**: N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺 (化合物P-3, 表P) 的製備。

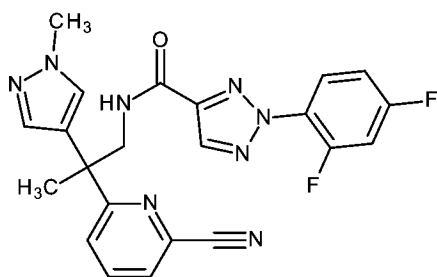
將2-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲酸鋰 (70.0 mg, 0.30 mmol) 和2-(6-氯-2-吡啶

基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙-1-胺 (91.0 mg, 0.36 mmol) 懸浮於乙酸乙酯 (5 mL) 中並在0°C下用三乙胺 (97.7  $\mu$ L, 0.66 mmol) 和EtOAc (2 mL) 中的T3P (50質量%) 處理。將反應在室溫下攪拌2小時，在此時間之後TLC和LCMS顯示反應完成。將反應混合物用水稀釋並用EtOAc (2 x 25 mL) 萃取。將合併的有機層用鹽水洗滌，經Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>乾燥並在真空中濃縮。將粗產物藉由使用0-70% EtOAc/環己烷作為洗提液的組合閃式層析法來純化以得到呈黃色黏性塊狀物的產物。

LCMS (方法C) : 458 [M+H]<sup>+</sup> ; 保留時間 = 1.19 min ;

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  ppm 8.28 (s, 1 H), 8.13 - 8.23 (m, 1 H), 7.89-7.95 (m, 1 H), 7.58 (t, J = 7.82 Hz, 1 H), 7.32 (s, 1 H), 7.16 - 7.25 (m, 2 H), 6.97 - 7.10 (m, 3 H), 4.03 (d, J = 6.36 Hz, 2 H), 3.88 (s, 3 H), 1.72 (s, 3 H)

**【0300】 實施例6** : N-[2-(6-氰基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺 (化合物P-2, 表P) 的製備。



(化合物P-2, 表P)。

將N-[2-(6-氰基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)三唑-5-甲醯胺 (0.1 g, 0.20 mmol) 和氰化鋅 (0.049 g, 0.41 mmol) 在無水N,N-二甲基甲醯胺 (1 mL) 中的溶液在氮氣下脫氣10分鐘。然後添加四(三苯基膦)鈾(0) (0.024 g, 0.020 mmol), 並且將所得的淡棕色懸浮液在120°C下在微波中攪拌3小時。反應完成後，將反應混合物用冰冷水稀釋並用EtOAc (2 x 25 mL) 萃取。將合併的有機層用鹽水洗滌，經Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>乾燥並在真空中濃縮。將粗產物在矽膠上吸收並藉由使用0-80% EtOAc/環己烷作為洗提液的組合閃式層析法來純化以得到呈白色黏性固體的產物。

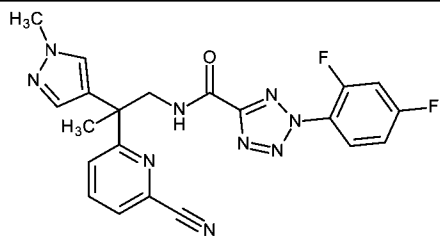
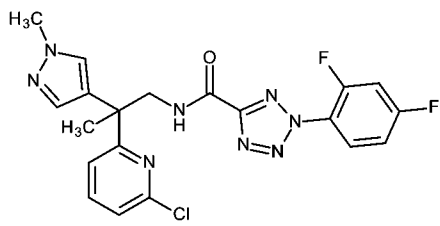
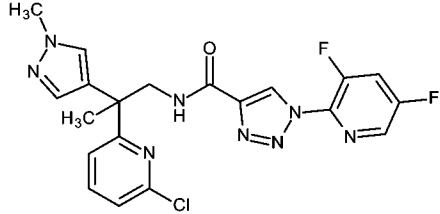
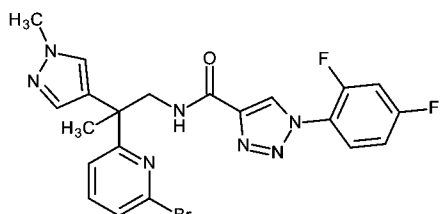
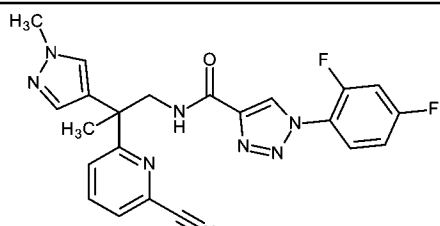
LCMS (方法B) : 449 [M+H]<sup>+</sup> ; 保留時間 = 1.07 min ;

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ ppm 8.28 (s, 1 H), 8.07 (brt, 1 H), 7.90- 7.94 (m, 1 H), 7.76 (t, J = 7.29 Hz, 1 H), 7.62 (d, J = 7.46 Hz, 1 H), 7.43 (d, J = 8.07 Hz, 1 H), 7.23 - 7.32 (m, 2 H), 7.02 - 7.11 (m, 2 H), 4.07 (d, J = 6.48 Hz, 2 H), 3.89 (s, 3 H), 1.74 (s, 3 H)

合成的具有式 (I) 的化合物的另外的實施例示出於表P中。

[表P] : 合成的化合物以及光譜和物理化學數據。

條目	IUPAC名稱	分子	RT (min)	[M+H] (測量的)	方法
P-1	<i>N</i> -[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-1-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺		1.09	459	B
P-2	<i>N</i> -[2-(6-氰基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺		1.07	448	B
P-3	<i>N</i> -[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺		1.19	459	C
P-4	<i>N</i> -[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-1-(2,4-二氟苯基)-1,2,4-三唑-3-甲醯胺		1.03	458	C

條目	IUPAC名稱	分子	RT (min)	[M+H] <sup>+</sup> (測量的)	方法
P-5	<i>N</i> -[2-(6-氰基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲醯胺		0.95	450	B
P-6	<i>N</i> -[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-2-(2,4-二氟苯基)四唑-5-甲醯胺		1.14	459	B
P-7	<i>N</i> -[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-1-(3,5-二氟-2-吡啶基)三唑-4-甲醯胺		1.70	459.49	F
P-8	<i>N</i> -[2-(6-溴-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-1-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺		1.12	502	E
P-9	<i>N</i> -[2-(6-氰基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-1-(2,4-二氟苯基)三唑-4-甲醯胺		1.04	449	E

### 生物學實施例

【0301】 實施例B1：茄鏈格孢菌 (*Alternaria solani*) / 番茄/葉圓片 (早枯病)

【0302】 將番茄葉圓片栽培品種貝比 (Baby) 置於多孔板 (24孔規格) 中的瓊脂上，並且用在水中稀釋的配製的測試化合物噴霧。在施用後2天，將葉圓片用真菌的孢子懸浮液接種。在氣候室中在12/12 h (光照/黑暗) 的光方案下，在23°C/21°C (白天/夜晚) 和80% rh下溫育接種的葉圓片，並且化合物的活性被評估為，在未處理的檢驗葉圓片上出現適當水平的病害損害時 (施用後5-7天)，與未處理的相比的病害控制百分比。

【0303】 當與在相同條件下顯示出廣泛的病害發展的未處理的對照相比時，以下化合物在200 ppm下給出對茄鏈格孢菌的至少80%的控制：

P-1、P-3、P-5、P-6、P-7、P-8

【0304】 **實施例B2：富克葡萄孢盤菌 (*Botryotinia fuckeliana*) (灰葡萄孢菌 (*Botrytis cinerea*))** /液體培養 (灰黴病)

【0305】 將來自冷凍儲存的真菌分生孢子直接混入營養培養液 (沃格爾 (Vogels) 培養液) 中。在將測試化合物的 (DMSO) 溶液置於微量滴定板 (96孔規格) 中之後，添加含有真菌孢子的營養培養液。將測試板在24°C下溫育並且在施用後3-4天藉由光度法測定對生長的抑制。

【0306】 當與在相同條件下顯示出廣泛的病害發展的未處理的對照相比時，以下化合物在20 ppm下給出對富克葡萄孢盤菌的至少80%的控制：

P-1、P-5、P-6、P-7、P-8

【0307】 **實施例B3：瓜小叢殼菌 (*Glomerella lagenarium*) (瓜類炭疽菌 (*Colletotrichum lagenarium*))** /液體培養 (炭疽病)

【0308】 將來自冷凍儲存的真菌分生孢子直接混入營養培養液 (PDB-馬鈴薯右旋糖培養液) 中。在將測試化合物的 (DMSO) 溶液置於微量滴定板 (96孔規格) 中之後，添加含有真菌孢子的營養培養液。將測試板在24°C下溫育並且在施用後3-4天藉由光度法測量對生長的抑制。

【0309】 當與在相同條件下顯示出廣泛的病害發展的未處理的對照相比時，以下化合物在20 ppm下給出對瓜小叢殼菌的至少80%的控制：

P-1、P-5、P-6、P-7、P-8

【0310】 **實施例B4：小麥白粉病菌 (*Blumeria graminis f. sp. tritici*)** (小麥白粉菌 (*Erysiphe graminis f. sp. Tritici*)) /小麥/葉圓片預防性 (小麥上的白粉病)

【0311】 將小麥葉段栽培品種坎斯勒 (Kanzler) 置於多孔板 (24孔規格) 中的瓊脂上，並且用在水中稀釋的配製的測試化合物噴霧。在施用後1天，藉由在該等測試板之上搖動白粉病感染的植物來接種葉圓片。在氣候室中在24 h黑暗、隨後是12 h光照/12 h黑暗的光方案下，在20°C和60% rh下溫育接種的葉圓片，並且化合物的活性被評估為，在未處理的檢驗葉段上出現適當水平的病害損害時 (施用後6-8天)，與未處理的相比的病害控制百分比。

【0312】 當與在相同條件下顯示出廣泛的病害發展的未處理的對照相比時，以下化合物在200 ppm下給出對小麥白粉病菌的至少80%的控制：

P-1、P-2、P-5、P-6、P-7、P-8、P-9

【0313】 **實施例B5：黃色镰刀菌 (*Fusarium culmorum*)** /液體培養 (赤黴病)

【0314】 將來自冷凍儲存的真菌分生孢子直接混入營養培養液 (PDB-馬鈴薯右旋糖培養液) 中。在將測試化合物的 (DMSO) 溶液置於微量滴定板 (96孔規格) 中之後，添加含有真菌孢子的營養培養液。將測試板在24°C下溫育並且在施用後3-4天藉由光度法測定對生長的抑制。

【0315】 當與在相同條件下顯示出廣泛的病害發展的未處理的對照相比時，以下化合物在20 ppm下給出對黃色镰刀菌的至少80%的控制：

P-1、P-6、P-7、P-8

【0316】 **實施例B6：黃色镰刀菌** /小麥/小穗預防性 (赤黴病)

【0317】 將小麥小穗栽培品種芒尚 (Monsoon) 置於多孔板 (24孔規格) 中的瓊脂上，並且用在水中稀釋的配製的測試化合物噴霧。在施用後1天，將小穗用真菌的孢子懸浮液接種。在氣候室中在72 h半黑暗、隨後是12 h光照/12 h黑暗的光方案下，在20°C和60% rh下溫育接種的小穗，並且化合物的活性被評估為，在未處理的檢驗小穗上出現適當水平的病害損害時 (施用後6-8天)，與未處理的相比的病害控制百分比。

【0318】 當與在相同條件下顯示出廣泛的病害發展的未處理的對照相比時，以下化合物在200 ppm下給出對黃色鐮刀菌的至少80%的控制：

P-6

【0319】 **實施例B7：穎枯殼針孢 (*Phaeosphaeria nodorum*, *Septoria nodorum*) /小麥/葉圓片預防性 (穎斑枯病)**

【0320】 將小麥葉段栽培品種坎斯勒 (Kanzler) 置於多孔板 (24孔規格) 中的瓊脂上，並且用在水中稀釋的配製的測試化合物噴霧。在施用後2天，將葉圓片用真菌的孢子懸浮液接種。在氣候室中在12 h光照/12 h黑暗的光方案下，在20°C和75% rh下溫育接種的測試葉圓片，並且化合物的活性被評估為，在未處理的檢驗葉圓片上出現適當水平的病害損害時 (施用後5-7天)，與未處理的相比的病害控制百分比。

【0321】 當與在相同條件下顯示出廣泛的病害發展的未處理的對照相比時，以下化合物在200 ppm下給出對穎枯殼針孢的至少80%的控制：

P-1、P-5、P-6、P-7、P-8、P-9

【0322】 **實施例B8：雪腐明梭孢 (*Monographella nivalis*) (雪黴葉枯菌)**  
/液體培養 (穀類根腐病)

【0323】 將來自冷凍儲存的真菌分生孢子直接混入營養培養液 (PDB-馬鈴薯右旋糖培養液) 中。在將測試化合物的 (DMSO) 溶液置於微量滴定板 (96

孔規格)中之後，添加含有真菌孢子的營養培養液。將測試板在24°C下溫育並且在施用後4-5天藉由光度法測定對生長的抑制。

【0324】 當與在相同條件下顯示出廣泛的病害發展的未處理的對照相比時，以下化合物在20 ppm下給出對雪腐明梭孢的至少80%的控制：

P-1、P-5、P-6、P-7、P-8、P-9

【0325】 **實施例B9：落花生球腔菌 (*Mycosphaerella arachidis*) (落花生尾孢菌 (*Cercospora arachidicola*)) /液體培養 (早期葉斑病)**

【0326】 將來自冷凍儲存的真菌分生孢子直接混入營養培養液 (PDB-馬鈴薯右旋糖培養液) 中。在將測試化合物的 (DMSO) 溶液置於微量滴定板 (96孔規格) 中之後，添加含有真菌孢子的營養培養液。將測試板在24°C下溫育並且在施用後4-5天藉由光度法測定對生長的抑制。

【0327】 當與在相同條件下顯示出廣泛的病害發展的未處理的對照相比時，以下化合物在20 ppm下給出對落花生球腔菌的至少80%的控制：

P-1、P-5、P-6、P-7、P-8

【0328】 **實施例B10：圓核腔菌 (*Pyrenophora teres*) /大麥/葉圓片預防性 (網斑病)**

【0329】 將大麥葉段栽培品種哈索 (Hasso) 置於多孔板 (24孔規格) 的瓊脂上，並且用在水中稀釋的配製的測試化合物噴霧。在施用後2天，將葉段用真菌的孢子懸浮液接種。在氣候室中在12 h光照/12 h黑暗的光方案下，在20°C和65% rh下溫育接種的葉段，並且化合物的活性被評估為，在未處理的檢驗葉段上出現適當水平的病害損害時 (施用後5-7天)，與未處理的相比的病害控制。

【0330】 當與在相同條件下顯示出廣泛的病害發展的未處理的對照相比時，以下化合物在200 ppm下給出對圓核腔菌的至少80%的控制：

P-1、P-3、P-5、P-6、P-7、P-8、P-9



【0331】 **實施例B11：核盤菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*)** /液體培養（棉狀腐病）

【0332】 將真菌的新生長的液體培養物的菌絲體片段直接混入營養培養液（PDB-馬鈴薯右旋糖培養液）中。在將測試化合物的（DMSO）溶液置於微量滴定板（96孔規格）中之後，添加含有真菌材料的營養培養液。將測試板在24°C下溫育並且在施用後3-4天藉由光度法測定對生長的抑制。

【0333】 當與在相同條件下顯示出廣泛的病害發展的未處理的對照相比時，以下化合物在20 ppm下給出對核盤菌的至少80%的控制：

P-5、P-6

【0334】 **實施例B12：禾生球腔菌 (*Mycosphaerella graminicola*)**（小麥殼針孢）/液體培養（葉枯病（*Septoria blotch*））

【0335】 將來自冷凍儲存的真菌分生孢子直接混入營養培養液（PDB-馬鈴薯右旋糖培養液）中。在將測試化合物的（DMSO）溶液置於微量滴定板（96孔規格）中之後，添加含有真菌孢子的營養培養液。將測試板在24°C下溫育並且在施用後4-5天藉由光度法測定對生長的抑制。

【0336】 當與在相同條件下顯示出廣泛的病害發展的未處理的對照相比時，以下化合物在20 ppm下給出對禾生球腔菌的至少80%的控制：

P-1、P-5、P-6、P-8、P-7、P-9

【0337】 **實施例B13：玉米赤黴 (*Gibberella zeae*)**（黃色镰刀菌（*Fusarium graminearum*））/小麥/小穗預防性（赤黴病）

【0338】 將小麥小穗栽培品種芒尚置於多孔板（24孔規格）中的瓊脂上，並且用在水中稀釋的配製的測試化合物噴霧。在施用後一天，將小穗用真菌的孢子懸浮液接種。在氣候室中在72 h半黑暗、隨後是12 h光照/12 h黑暗的光方案下，在20°C和60% rh下溫育接種的測試葉圓片，化合物的活性被評估為，在未處理的

檢驗小穗上出現適當水平的病害損害時（施用後6-8天），與未處理的相比的病害控制百分比。

【0339】 當與在相同條件下顯示出廣泛的病害發展的未處理的對照相比時，以下化合物在200 ppm下給出對玉米赤黴的至少80%的控制：

P-7

【0340】 **實施例B14：致病疫黴菌 (*Phytophthora infestans*) / 番茄/葉圓片預防性（晚疫病）**

【0341】 將番茄葉圓片置於多孔板（24孔格式）中的水瓊脂上，並且用稀釋於水中的配製的測試化合物進行噴霧。在施用後1天，將葉圓片用真菌的孢子懸浮液接種。在氣候室中在24 h黑暗、隨後是12 h光照/12 h黑暗的光方案下，在16°C和75% rh下溫育接種的葉圓片，並且化合物的活性被評估為，在未處理的檢驗葉圓片中出現適當水平的病害損害時（施用後5-7天），與未處理的相比的病害控制百分比。

【0342】 當與在相同條件下顯示出廣泛的病害發展的未處理的對照相比時，以下化合物在200 ppm下給出對致病疫黴菌的至少80%的控制：

P-2

【0343】 **實施例B15：葡萄霜黴病菌 (*Plasmopara viticola*) / 葡萄/葉圓片預防性（晚疫病）**

【0344】 將葡萄藤葉圓片置於多孔板（24孔規格）中的水瓊脂上，並且用在水中稀釋的配製的測試化合物噴霧。在施用後1天，將葉圓片用真菌的孢子懸浮液接種。在氣候室中在12 h光照/12 h黑暗的光方案下，在19°C和80% rh下溫育接種的葉圓片，並且化合物的活性被評估為，在未處理的檢驗葉圓片中出現適當水平的病害損害時（施用後6-8天），與未處理的相比的病害控制百分比。

【0345】 當與在相同條件下顯示出廣泛的病害發展的未處理的對照相比

時，以下化合物在200 ppm下給出對葡萄霜黴病菌的至少80%的控制：

P-1、P-2

**【0346】 實施例B16：稻瘟病菌 (*Magnaporthe grisea*) (稻梨孢) /液體培養 (稻瘟病)**

**【0347】** 將來自冷凍儲存的真菌分生孢子直接混入營養培養液 (PDB-馬鈴薯右旋糖培養液) 中。在將測試化合物的 (DMSO) 溶液置於微量滴定板 (96孔規格) 中之後，添加含有真菌孢子的營養培養液。將測試板在24°C下溫育並且在施用後3-4天藉由光度法測定對生長的抑制。

**【0348】** 當與未處理的相比時，以下化合物在20 ppm下給出對稻瘟病菌的至少80%的控制。

**【符號說明】**

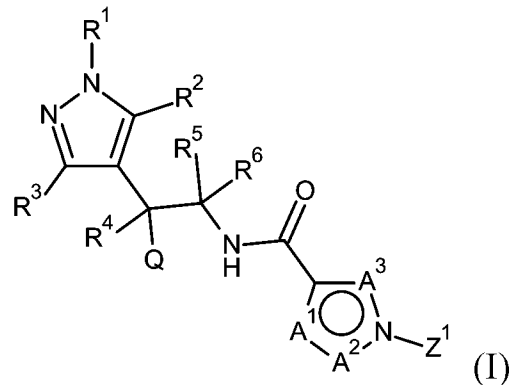
**【0349】** 無

**【生物材料寄存】**

**【0350】** 無

## 【發明申請專利範圍】

【請求項1】一種具有式 (I) 的化合物，



其中

R<sup>1</sup>選自氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基；

R<sup>2</sup>選自氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基羰基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-碳醯亞胺基、N-羥基-C-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-碳醯亞胺基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基羰基；

R<sup>3</sup>選自氫、鹵素、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基；

R<sup>4</sup>選自氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基胺基羰基、或二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基胺基)羰基；

R<sup>5</sup>和R<sup>6</sup>獨立地選自氫、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基；

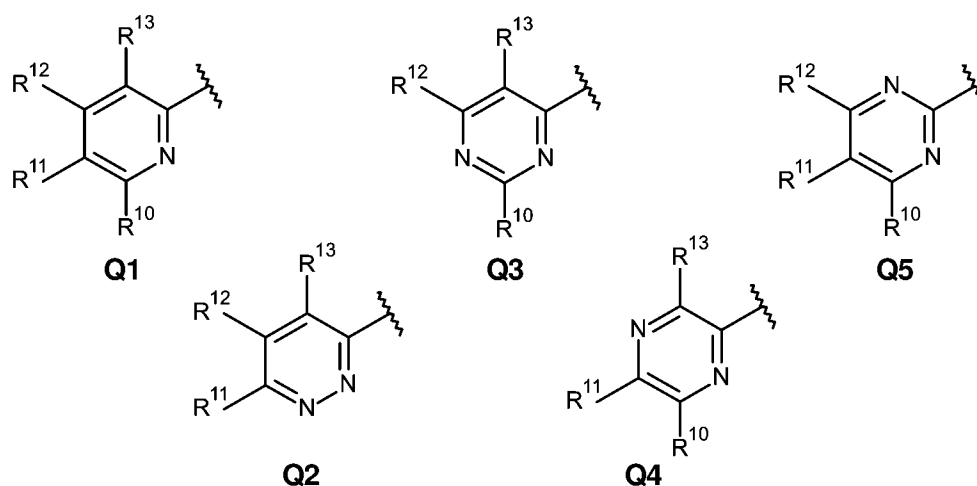
A<sup>1</sup>選自CR<sup>7</sup>或N，

A<sup>2</sup>選自CR<sup>8</sup>或N；

A<sup>3</sup>選自CR<sup>9</sup>或N；

R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>和R<sup>9</sup>獨立地選自氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基；

Q選自Q1、Q2、Q3、Q4、或Q5；



其中；

R<sup>10</sup>、R<sup>11</sup>、R<sup>12</sup>和R<sup>13</sup>獨立地選自氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基氫硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亞磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、N-C<sub>1-4</sub>烷基胺基、N,N-二C<sub>1-4</sub>烷基胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基羰基、N-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-碳醯亞胺基、N-羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基-碳醯亞胺基、羥基、三氟甲基磺醯氧基、氰基、羧基、胺基、苯基、5員或6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，其中所述5員或6員雜芳基包含1、2、3或4個單獨地選自N、O或S的雜原子；並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基中的任一個係未取代的或被1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基；

Z<sup>1</sup>選自C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、苯基、5員或6員雜芳基、或C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基，其中所述5員或6員雜芳基中的任一個包含1、2、3或4個單獨地選自N、O或S的雜原子；並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基中的任一個係未取代的或被1、2或3個取代基取代，該等取代基獨立地選自鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵代烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基氫硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基亞磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基磺醯基、或C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基；

或其農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物或N-氧

化物。

【請求項2】如請求項1所述之具有式 (I) 的化合物，其中， $A^1$ 選自CH或N； $A^2$ 選自CH或N； $A^3$ 選自CH或N；且其中 $A^1$ 、 $A^2$ 和 $A^3$ 中的至少兩個選自N。

【請求項3】如請求項1或請求項2所述之具有式 (I) 的化合物，其中， $R^1$ 選自甲基、乙基、或異丙基。

【請求項4】如請求項1至3中任一項所述之具有式 (I) 的化合物，其中， $R^2$ 選自氫、氟、氯、或甲基。

【請求項5】如請求項1至4中任一項所述之具有式 (I) 的化合物，其中， $R^3$ 選自氫或甲基。

【請求項6】如請求項1至5中任一項所述之具有式 (I) 的化合物，其中， $R^4$ 選自氫或甲基。

【請求項7】如請求項1至6中任一項所述之具有式 (I) 的化合物，其中， $R^5$ 和 $R^6$ 獨立地選自氫或甲基。

【請求項8】如請求項1至7中任一項所述之具有式 (I) 的化合物，其中，Q選自Q1、Q2、或Q3。

【請求項9】如請求項1至8中任一項所述之具有式 (I) 的化合物，其中， $R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、氯、溴、甲氧基、氰基、胺基、2-氰基苯基、3-氰基苯基、4-氰基苯基、(3-氰基吡啶-1-基)、(4-氰基吡啶-1-基)、(3,5-二甲基吡啶-1-基)、(5-甲基吡啶-1-基)、(4-甲基吡啶-1-基)、(3-甲基吡啶-1-基)、吡啶-1-基、環丙基、或1-氰基環丙基；並且

$R^{12}$ 和 $R^{13}$ 係氫。

【請求項10】如請求項9所述之具有式 (I) 的化合物，其中， $R^{10}$ 和 $R^{11}$ 獨立地選自氫、氯、溴、氰基、或胺基。

【請求項11】如請求項1至10中任一項所述之具有式 (I) 的化合物，其中，

Z<sup>1</sup>選自1-甲基吡啶-4-基、2,3,4-三氟苯基、2,3-二氟苯基、3,4-二氟苯基、2,4,6-三氟苯基、2,4-二氟苯基、2,5-二氟苯基、3,5-二氟-2-吡啶基、5-氟-2-吡啶基、3-氟-2-吡啶基、2-氟-4-甲氧基-苯基、2-氟-4-甲基磺醯基-苯基、2-氟苯基、3-氟苯基、4-氟苯基、3,5-二氟-2-呋喃基、3-氟-2-呋喃基、5-氟-2-呋喃基、3,5-二氟-2-噻吩基、3-氟-2-噻吩基、5-氟-2-噻吩基、2-甲基苯基、3-甲基苯基、4-甲基苯基、2-氯苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、3-甲氧基苯基、4-乙炔基-2-氟-苯基、4-氟-2-甲氧基-苯基、環丙基、1-甲基環丙基、環丁基、環己基、環戊基、甲基、正丙基、或苯基。

【請求項12】如請求項1至11中任一項所述之具有式 (I) 的化合物，其中，Z<sup>1</sup>選自1-甲基吡啶-4-基、2,4,6-三氟苯基、3,5-二氟-2-吡啶基、2,4-二氟苯基、2-氟苯基、2-呋喃基、2-甲基苯基、2-噻吩基、3,4-二氟苯基、3-氯苯基、3-噻吩基、4-氟-2-甲氧基-苯基、4-氟苯基、環丁基、環己基、環戊基、或苯基。

【請求項13】一種農用化學組成物，其包含殺真菌有效量的如請求項1至12中任一項所定義的具有式 (I) 的化合物。

【請求項14】一種控制或預防有用植物被植物病原性微生物侵染之方法，其中將殺真菌有效量的如請求項1至12中任一項所定義的具有式 (I) 的化合物或包含該具有式 (I) 的化合物的組成物施用至所述植物、其部分或其場所。

【請求項15】一種如請求項1至12中任一項所述之化合物的用途，其係作為殺真菌劑。