

# 發明專利說明書

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：96112747

COD 401/04

※申請日期：96.4.11

※IPC 分類：~~A01N~~

COD 493/04

COD 495/04

## 一、發明名稱：(中文/英文)

A01N 43/707

作為殺真菌劑之3-(吡啶-2-基)-[1,2,4]-三吡

A01N 43/40

3-(PYRIDIN-2-YL)-[1,2,4]-TRIAZINES AS FUNGICIDES

A01P 3/00

## 二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

德商巴地斯顏料化工廠

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

代表人：(中文/英文)

1. 希奈克  
CIMNIAK

2. 瓦隆  
WALLON

住居所或營業所地址：(中文/英文)

德國勞域沙芬市

67056 LUDWIGSHAFEN, GERMANY

國籍：(中文/英文)

德國 GERMANY

三、發明人：(共 7 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 瓦希琉斯 葛蘭梅諾  
GRAMMENOS, WASSILIOS
2. 湯瑪士 葛洛帝  
GROTE, THOMAS
3. 裘成 戴伊茲  
DIETZ, JOCHEN
4. 珍 科拉司 龍門  
LOHMANN, JAN KLAAS
5. 貞斯 仁諾爾  
RENNER, JENS
6. 本德 慕勒  
MUELLER, BERND
7. 莎拉 奧舒尼德  
ULMSCHNEIDER, SARAH

國 籍：(中文/英文)

1. 希臘 GREECE
2. 德國 GERMANY
3. 德國 GERMANY
4. 德國 GERMANY
5. 德國 GERMANY
6. 德國 GERMANY
7. 德國 GERMANY

#### 四、聲明事項：

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

申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1. 歐洲專利機構；2006年04月12日；06007743.5

2.

無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1.

2.

主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

主張專利法第三十條生物材料：

須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

## 九、發明說明：

## 【發明所屬之技術領域】

本發明係關於3-(吡啶-2-基)-[1,2,4]-三吡及其用於控制有害真菌之用途，且亦係關於包含此等化合物作為活性組份之農作物保護組合物。

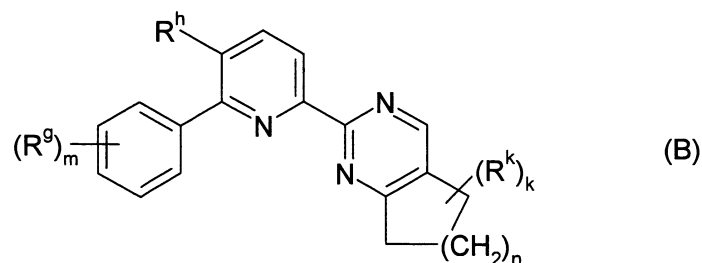
## 【先前技術】

EP-A 234 104描述於吡啶基之6位具有烷基且可於嘧啶環之3、4位具有稠合飽和5或6員環之2-(吡啶-2-基)嘧啶。該等化合物適用於控制植物病原性真菌(有害真菌)。

於嘧啶環之4位具有視情況經取代之苯環之具有殺真菌作用的2-(吡啶-2-基)嘧啶由US 4,873,248已知。

EP-A 259 139描述於吡啶基之6位具有視情況經取代之苯基且可於嘧啶環之3、4位具有稠合飽和5或6員環之2-(吡啶-2-基)嘧啶。該等化合物同樣適用於控制植物病原性真菌(有害真菌)。

WO 2006/010570描述下式B之殺真菌活性2-(6-苯基吡啶-2-基)嘧啶化合物：



其中：k為0、1、2或3，m為0、1、2、3、4或5且n為1、2、3、4或5，取代基 $R^g$ 尤其為鹵素、OH、CN、NO<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵烷氧基、

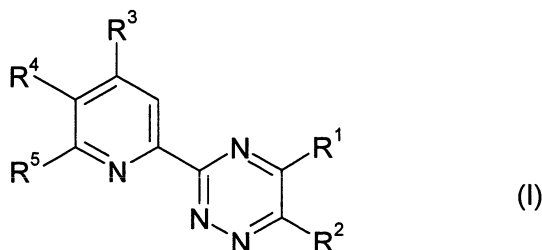
C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、胺基、苯氧基等，R<sup>h</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵烷氧基、羥基、鹵素、CN或NO<sub>2</sub>且R<sup>k</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基。

關於其殺真菌活性，由先前技術已知之一些2-(吡啶-2-基)嘓啶不合要求，或其具有諸如低農作物相容性之不良特性。

### 【發明內容】

因此，本發明之目標在於提供具有改良之殺真菌活性及/或更佳農作物相容性之新穎化合物。

令人驚訝地，此目標係藉由通式I之3-(吡啶-2-基)-[1,2,4]-三嘓化合物及式I化合物之農業上適用之鹽而達成：



其中：

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>彼此獨立地為OH、鹵素、NO<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷胺基或二(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基)胺基，

或與其所連接之碳原子一起可形成飽和5、6或7員碳環或雜環，該雜環除碳環成員以外另具有一或兩個選自由氧及硫組成之群之雜原子作為環成員，其

中碳環及雜環為未經取代或具有1、2、3或4個C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基作為取代基；

R<sup>3</sup> 為氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基甲基或鹵素；

R<sup>4</sup> 為氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵烷氧基或鹵素；

R<sup>5</sup> 為C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>環烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>環烷氧基、5或6員雜芳基、苯基、苯氧基、苄基、苄氧基、5或6員雜芳基甲基或5或6員雜芳氧基，其中上述環基為未經取代或可具有1、2、3、4或5個R<sup>a</sup>基團，其中：

R<sup>a</sup>係選自由以下各基組成之群：OH、SH、鹵素、NO<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、CN、COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷胺基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基)胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基亞磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷基亞磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷基磺醯基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>環烷基、苯基、苯氧基及式C(=Z)R<sup>aa</sup>之基團(其中Z為O、S、N(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基)、N(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基)、N(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>烯氧基)或N(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>炔氧基)且R<sup>aa</sup>為氫、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基、NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷胺基或二(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基)胺基)，或兩個連接至相鄰碳原子之R<sup>a</sup>基團與其所連接之碳原子一起亦可形成飽和5、6或7員碳環、苯

環或5、6或7員雜環，該雜環除碳環成員以外另具有一或兩個選自由氧及硫組成之群之雜原子作為環成員，其中碳環及雜環為未經取代或具有1、2、3或4個C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基作為取代基。

因此，本發明提供通式I之3-(吡啶-2-基)三吡及其農業上可接受之鹽。

另外，本發明提供通式I之3-(吡啶-2-基)三吡及其農業上可接受之鹽用於控制植物病原性真菌(=有害真菌)之用途，且亦提供控制植物病原性真菌之方法，其中真菌或待保護以免於真菌侵襲之材料、植物、土壤或種子係經有效量之通式I化合物及/或I之農業上可接受之鹽處理。

另外，本發明提供用於控制有害真菌且包含至少一種通式I之3-(吡啶-2-基)三吡化合物及/或其農業上可接受之鹽及至少一種液體或固體載劑之組合物。

視取代型而定，式I化合物及其互變異構體可具有一或多個對掌性中心，在該情況下其係以純對映異構體或純非對映異構體或以對映異構體或非對映異構體混合物之形式存在。本發明提供純對映異構體或非對映異構體及其混合物。

農業上適用之鹽尤其涵蓋彼等陽離子之鹽或其陽離子及陰離子分別對化合物I之殺真菌作用具有不利效應之彼等酸的酸加成鹽。因此，詳言之，合適陽離子為鹼金屬離子，較佳為鈉及鉀之離子；鹼土金屬離子，較佳為鈣、鎂及鋇之離子；過渡金屬離子，較佳為錳、銅、鋅及鐵之離

子以及銨離子，若需要，銨離子可具有一至四個  $C_1-C_4$  烷基取代基及/或一個苯基或苄基取代基，較佳為二異丙基銨、四甲基銨、四丁基銨、三甲基苄基銨；另外為磷離子；銻離子，較佳為三( $C_1-C_4$ 烷基)銻及氧銻離子，較佳為三( $C_1-C_4$ 烷基)氧銻。

適用酸加成鹽之陰離子主要為氯離子、溴離子、氟離子、硫酸氫根、硫酸根、磷酸二氫根、磷酸氫根、磷酸根、硝酸根、碳酸氫根、碳酸根、六氟矽酸根、六氟磷酸根、苯甲酸根及  $C_1-C_4$  烷酸之陰離子，較佳為甲酸根、乙酸根、丙酸根及丁酸根。該等陰離子可藉由使 I 與相應陰離子之酸(較佳為氫氯酸、氫溴酸、硫酸、磷酸或硝酸)反應而形成。

在上式所給變數之定義中，使用一般表示所論及取代基之統稱術語。術語  $C_n-C_m$  指示在各情況下所論及取代基或取代基部分中可能之碳原子數：

鹵素：氟、氯、溴及碘；

烷基以及烷氧基、烷氧基烷基、烷羰基、烷氧羰基、烷硫基、烷基磺醯基、烷基亞磺醯基、烷胺基、二烷胺基、烷胺基羰基、二烷胺基羰基中之所有烷基部分：具有 1 至 8 個 ( $C_1-C_8$  烷基)、經常為 1 至 6 個 ( $C_1-C_6$  烷基) 及詳言之 1 至 4 個碳原子 ( $C_1-C_4$  烷基) 之飽和、直鏈或支鏈烴基，諸如甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、戊基、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、己基、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-甲基丙基及1-乙基-2-甲基丙基、庚基、1-甲基己基、辛基、1-甲基庚基及2-乙基己基；

鹵烷基以及鹵烷氧基及鹵烷硫基中之所有鹵烷基部分：具有1至8個且詳言之1至4個碳原子之直鏈或支鏈烷基(如上所述)，其中該等基團中之一些或所有氫原子可經如上所述之鹵素原子(詳言之為氟或氯)置換：詳言之為C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>鹵烷基，諸如氟甲基、溴甲基、二氟甲基、三氟甲基、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、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、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、五氟乙基及1,1,1-三氟丙-2-基；

烯基：具有2至8個或3至8個碳原子及任何位置之雙鍵的單不飽和、直鏈或支鏈烴基，例如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基；

炔基：具有2至8個或3至8個碳原子及任何位置之參鍵之直鏈或支鏈烴基，例如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-

丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基；

**環烷基**：具有3至8個，較佳6個碳環成員之單環飽和烴基，諸如環丙基、環丁基、環戊基及環己基；

**環烷基甲基**：經由亞甲基( $\text{CH}_2$ )連接之如上所述環烷基；

**烷胺基以及烷胺基羰基中之烷胺基部分**：經由NH基團連接之烷基，其中烷基為上述具有1至8個碳原子之烷基中之一者，諸如甲胺基、乙胺基、正丙胺基、異丙胺基、正丁胺基及其類似基團；

**二烷胺基以及二烷胺基羰基中之二烷胺基部分**：式 $\text{N}(\text{烷基})_2$ 之基團，其中烷基為上述具有1至8個碳原子之烷基中之一者，例如二甲胺基、二乙胺基、甲基乙胺基、N-甲基-N-丙胺基及其類似基團；

**烷氧基以及烷氧羰基中之烷氧基部分**：具有1至8個，詳言之1至6個且尤其1至4個碳原子之經由氧連接之烷基，例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、1-甲基乙氧基、丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基或1,1-二甲基乙氧基；

**烷氧羰基**：經由羰基連接之如上所述烷氧基；

**烷硫基**：經由硫原子連接之如上所述烷基；

**烷基亞磺醯基**：經由 $\text{S}(=\text{O})$ 基團連接之如上所述烷基；

**烷基磺醯基**：經由 $\text{S}(=\text{O})_2$ 基團連接之如上所述烷基；

**鹵烷氧基**：經氟、氯、溴及/或碘部分或完全取代，較佳經氟取代之如上所述具有1至8個，詳言之1至6個且尤其為1至4個碳原子之烷氧基，亦即例如 $\text{OCH}_2\text{F}$ 、 $\text{OCHF}_2$ 、

OCF<sub>3</sub>、OCH<sub>2</sub>Cl、OCHCl<sub>2</sub>、OCCl<sub>3</sub>、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、2-氟乙氧基、2-氯乙氧基、2-溴乙氧基、2-碘乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、OC<sub>2</sub>F<sub>5</sub>、2-氟丙氧基、3-氟丙氧基、2,2-二氟丙氧基、2,3-二氟丙氧基、2-氯丙氧基、3-氯丙氧基、2,3-二氯丙氧基、2-溴丙氧基、3-溴丙氧基、3,3,3-三氟丙氧基、3,3,3-三氯丙氧基、OCH<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>、OCF<sub>2</sub>-C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>、1-(CH<sub>2</sub>F)-2-氟乙氧基、1-(CH<sub>2</sub>Cl)-2-氯乙氧基、1-(CH<sub>2</sub>Br)-2-溴乙氧基、4-氟丁氧基、4-氯丁氧基、4-溴丁氧基或九氟丁氧基；

**伸烷基：**具有2至6個且詳言之2至4個碳原子之直鏈飽和烴鏈，諸如乙烷-1,2-二基、丙烷-1,3-二基、丁烷-1,4-二基、戊烷-1,5-二基或己烷-1,6-二基。

具有一或兩個選自由氧及硫組成之群之雜原子作為環成員之飽和5、6或7員雜環：由碳原子及1或2個選自由氧及硫組成之群之雜原子構成之環，環原子(環成員)之總數為5、6或7，例如：氧雜環戊烷、氧雜環庚烷、噁烷(四氫呋喃)、1,3-二氧雜環戊烷、1,3-二噁烷、1,4-二噁烷、硫雜環戊烷、硫雜環己烷、硫雜環庚烷、1,3-二硫雜環戊烷、1,3-二硫雜環己烷及1,4-二硫雜環己烷；

**5或6員雜芳基：**除碳以外另具有1、2、3或4個雜原子作為環成員之5或6員芳環，該等雜原子通常係選自由氧、氮及硫組成之群，詳言之為：

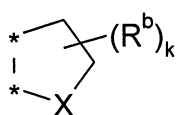
- 具有1、2、3或4個氮原子作為環成員之5員雜芳基，諸如1-、2-或3-吡咯基、1-、3-或4-吡唑基、1-、2-或4-咪唑基、1,2,3-[1H]-三唑-1-基、1,2,3-[2H]-三唑-2-基、1,2,3-[1H]-三唑-4-基、1,2,3-[1H]-三唑-5-基、1,2,3-[2H]-三唑-4-基、1,2,4-[1H]-三唑-1-基、1,2,4-[1H]-三唑-3-基、1,2,4-[1H]-三唑-5-基、1,2,4-[4H]-三唑-4-基、1,2,4-[4H]-三唑-3-基、[1H]-四唑-1-基、[1H]-四唑-5-基、[2H]-四唑-2-基及[2H]-四唑-5-基；
- 具有1個選自由氧及硫組成之群之雜原子及視情況選用1、2或3個氮原子作為環成員之5員雜芳基，例如2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、3-或4-異噁唑基、3-或4-異噻唑基、2-、4-或5-噁唑基、2-、4或5-噻唑基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,3,4-噻二唑-2-基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基及1,3,4-噁二唑-2-基；
- 具有1、2、3或4個氮原子作為環成員之6員雜芳基，諸如2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、3-噻嗪基、4-噻嗪基、1,2,4-三吡嗪-3-基、1,2,4-三吡嗪-5-基、1,2,4-三吡嗪-6-基及1,3,5-三吡嗪基。

就用作殺真菌劑而言，較佳為其中變數 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 及 $R^5$ 彼此獨立且詳言之其組合具有下列含義之彼等式I化合物：

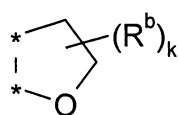
根據本發明之第一實施例， $R^1$ 及 $R^2$ 彼此獨立地為單價基

團。此處， $R^1$ 及 $R^2$ 可為相同或不同的。在此情況下，其較佳選自由以下基團組成之群：氟、氯、 $C_1$ - $C_4$ 烷基(尤其為甲基、乙基或正丙基)，此外為甲氧基、乙氧基、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、 $OCF_3$ 及 $OCHF_2$ 。

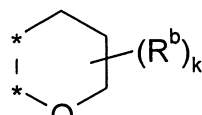
根據本發明之第二實施例， $R^1$ 及 $R^2$ 與其所連接之碳原子一起形成如上文所定義且可具有一或多個 $C_1$ - $C_4$ 烷基作為取代基之飽和5、6或7員碳環或雜環。在該實施例中， $R^1$ 及 $R^2$ 與其所連接之三吡環之碳原子一起較佳為以下環中之一者：



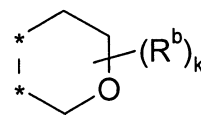
Q-1



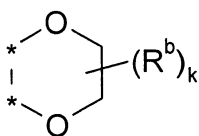
Q-2



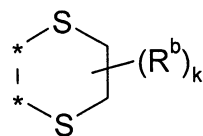
Q-3



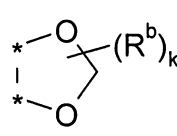
Q-4



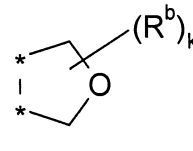
Q-5



Q-6



Q-7



Q-8

其中：

\* 為三吡環之原子；

k 為0、1、2、3或4；

$R^b$  為 $C_1$ - $C_4$ 烷基，詳言之為甲基；且

X 為 $(CH_2)_n$ ，其中 $n=1$ 、2或3。

基團 $R^b$ 可位於該等環之任何碳原子處，且例如若 $k \neq 0$ ，則 $(CH_2)_n$ 中之1、2、3或4個氫原子可經 $R^b$ 置換。基團Q-2、Q-3及Q-4可假定關於三吡環之任何方位。在基團Q-1至

Q-8中，尤其較佳為基團Q-1且尤其為其中 $n=2$ 或 $3$ 之基團Q-1。變數 $k$ 尤其為 $0$ 、 $1$ 或 $2$ 。

$R^3$ 較佳為氫、氟、氯、 $C_1$ - $C_4$ 烷基(尤其為甲基、乙基、異丙基或第三丁基)、甲氧基、乙氧基、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、 $OCF_3$ 或 $OCHF_2$ ，尤其為氫或甲基。此外，尤其較佳者為其中 $R^3$ 為氯之式I化合物。此外，尤其較佳者為其中 $R^3$ 為 $CF_3$ 之式I化合物。此外，尤其較佳者為其中 $R^3$ 為甲氧基或乙氧基之式I化合物。

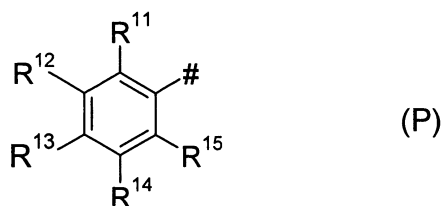
$R^4$ 較佳為氫、氟、氯、 $C_1$ - $C_4$ 烷基(尤其為甲基或乙基)、甲氧基、乙氧基、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、 $OCF_3$ 或 $OCHF_2$ 。詳言之， $R^4$ 為氫、氟、氯或甲基。

在式I之較佳化合物中， $R^5$ 為苯基、苯氧基或苄基，其中上述三個基團中之苯環為未經取代或具有 $1$ 、 $2$ 、 $3$ 、 $4$ 或 $5$ 個 $R^a$ 基團，詳言之為 $1$ 、 $2$ 或 $3$ 個 $R^a$ 基團。

較佳基團 $R^a$ 係選自由以下基團組成之群：鹵素、 $C_1$ - $C_4$ 烷基、 $C_1$ - $C_2$ 鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基、 $C_1$ - $C_2$ 鹵烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基、 $C_1$ - $C_4$ 烷羰基、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧羰基及式 $C(=N-O-C_1-C_8$ 烷基) $R^{aa}$ 之基團(其中 $R^{aa}$ 為氫或 $C_1$ - $C_4$ 烷基)。尤其較佳地， $R^a$ 基團係選自由以下基團組成之群：鹵素(尤其為氯或氟)、甲基、甲氧基、三氟甲基、二氟甲基、三氟甲氧基、二氟甲氧基及甲硫基。

根據本發明之較佳實施例，式I中之 $R^5$ 為苯基、苯氧基或苄基，其中苯環具有 $1$ 、 $2$ 、 $3$ 、 $4$ 或 $5$ 個且詳言之 $1$ 、 $2$ 或 $3$ 個 $R^a$ 基團，其中 $R^a$ 基團較佳選自所述較佳之 $R^a$ 基團，且詳

言之選自所述尤其較佳之 $R^a$ 基團。在該實施例中，苯基、苯氧基或苄基中之苯基為式P之基團：



其中#為吡啶環之連接點且 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 及 $R^{15}$ 為氫或該等基團中之至少一者，例如該等基團中之1、2、3、4或5者且具有關於 $R^a$ 給定之含義之一，詳言之為給定之較佳或尤其較佳之含義之一。在一較佳實施例中，基團 $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 或 $R^{15}$ 中之至少一者且尤其為1、2或3者不同於氫。詳言之：

$R^{11}$  為氫、氟、氯、 $CH_3$ 、 $OCH_3$ 、 $OCHF_2$ 、 $OCF_3$ 或 $CF_3$ ；

$R^{12}$ 、 $R^{14}$ 彼此獨立地為氫、氟、氯、 $CH_3$ 、 $OCH_3$ 、 $OCHF_2$ 、 $OCF_3$ 或 $CF_3$ ，其中基團 $R^{12}$ 及 $R^{14}$ 中之一者亦可為 $NO_2$ 、 $C(O)CH_3$ 或 $COOCH_3$ ；詳言之， $R^{12}$ 及 $R^{14}$ 為氫、氟、甲基或三氟甲基；

$R^{13}$  為氫、氟、氯、氟基、 $OH$ 、 $CHO$ 、 $NO_2$ 、 $NH_2$ 、甲胺基、二甲胺基、二乙胺基、 $C_1$ - $C_4$ 烷基(尤其為 $CH_3$ 、 $C_2H_5$ 、 $CH(CH_3)_2$ )、 $C_3$ - $C_8$ 環烷基(尤其為環丙基、環戊基或環己基)、 $C_1$ - $C_4$ 烷氧基(尤其為 $OCH_3$ )、 $C_1$ - $C_4$ 烷硫基(尤其為甲硫基或乙硫基)、 $C_1$ - $C_4$ 鹵烷基(尤其為 $CF_3$ )、 $C_1$ - $C_4$ 鹵烷氧基(尤其為 $OCHF_2$ 或 $OCF_3$ )或 $CO(A^2)$ (其中 $A^2$ 為 $C_1$ - $C_4$ 烷

基，尤其為甲基；或  $C_1-C_4$  烷氧基，尤其為  $OCH_3$ ；或基團  $C(R^{13a})=NOR^{13b}$ ，其中  $R^{13a}$  為氫或甲基且  $R^{13b}$  為  $C_1-C_4$  烷基、炔丙基或烯丙基或  $R^{12}$  及  $R^{13}$  一起形成基團  $O-CH_2-O$ ；且

$R^{15}$  為氫、氟、氯或  $C_1-C_4$  烷基(尤其為  $CH_3$ )，詳言之為氫或氟。

有利地，若基團  $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$  或  $R^{15}$  中一者以上不同於氫，則不同於氫之基團中僅一者不同於鹵素或甲基。特別地，若基團  $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$  或  $R^{15}$  中之一者不同於氫、鹵素或甲基，則剩餘基團  $R^{11}$ 、 $R^{12}$ 、 $R^{13}$ 、 $R^{14}$ 、 $R^{15}$  係選自由鹵素及氫組成之群。

基團 P 之實例為下述基團：苯基、2-氟苯基、3-氟苯基、4-氟苯基、2-氯苯基、3-氯苯基、4-氯苯基、3-溴苯基、4-溴苯基、2-三氟甲基苯基、3-三氟甲基苯基、4-三氟甲基苯基、2-(甲硫基)苯基、3-(甲硫基)苯基、4-(甲硫基)苯基、2-甲氧基苯基、3-甲氧基苯基、4-甲氧基苯基、4-硝基苯基、4-氰基苯基、4-第三丁基苯基、4-異丙基苯基、3-乙氧基苯基、4-乙氧基苯基、4-正丙氧基苯基、4-異丙氧基苯基、3-異丙氧基苯基、4-正丁氧基苯基、4-第三丁氧基苯基、4-乙醯基苯基、4-甲氧羰基苯基、4-乙氧羰基苯基、4-第三丁氧羰基苯基、4-(甲氧基亞胺基甲基)苯基、4-(1-(甲氧基亞胺基)乙基)苯基、2,3-二氟苯基、2,4-二氟苯基、2,5-二氟苯基、3,4-二氟苯基、3,5-二氟苯基、2,6-二氟苯基、2,4,6-三氟苯基、2,4,5-三氟苯基、



2,3,4-三氟苯基、2,3,5-三氟苯基、3,4,5-三氟苯基、2,3-二氟苯基、2,5-二氟苯基、3,5-二氟苯基、2,6-二氟苯基、2,3-二甲基苯基、2,4-二甲基苯基、2,5-二甲基苯基、2,4,5-三甲基苯基、2,3-二甲氧基苯基、2,4-二甲氧基苯基、3,4-二甲氧基苯基、2,4-雙(三氟甲基)苯基、3,5-雙(三氟甲基)苯基、2-甲基-3-甲氧基苯基、2-甲基-4-甲氧基苯基、2-甲基-6-甲氧基苯基、3-氟-4-氟苯基、2-氟-4-氟苯基、2-氟-6-氟苯基、4-氟-2-氟苯基、5-氟-2-氟苯基、4-氟-3-甲基苯基、2-氟-4-甲基苯基、4-氟-2-甲基苯基、2-氟-3-甲氧基苯基、2-氟-4-甲氧基苯基、2-氟-6-甲氧基苯基、2-氟-4-三氟甲基苯基、4-氟-3-甲基苯基、2-氟-4-甲基苯基、2-氟-6-甲基苯基、3-氟-2-甲基苯基、5-氟-2-甲基苯基、2-氟-4-甲氧基苯基、2-氟-6-甲氧基苯基、2-氟-4-三氟甲基苯基、3-氟-4-甲基苯基、4-氟-3-甲基苯基、3-氟-4-甲氧基苯基、3-氟-4-乙氧基苯基、3-氟-4-三氟甲基苯基、3-氟-4-甲基苯基、3-氟-4-甲氧基苯基、3-氟-4-乙氧基苯基、3-氟-4-三氟甲基苯基、3-甲基-4-甲氧基苯基、4-氟-2,5-二氟苯基、4-第三丁基-2-氟苯基、2-氟-4-異丙基苯基、4-乙氧基-2-氟苯基、4-乙醯基-2-氟苯基、2-甲基苯基、3-甲基苯基、4-甲基苯基、2-乙基苯基、3-乙基苯基、4-乙基苯基。

特別較佳地，式I中之 $R^5$ 為苯基且尤其為基團P且詳言之為本文以實例展示之基團P中之一者。

根據另一較佳實施例， $R^5$ 為 $C_1-C_6$ 烷基或 $C_1-C_6$ 鹵烷基，

詳言之為 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 烷基，尤其為正丙基、異丙基、第三丁基、1,2-二甲基丙基或 1,2,2-三甲基丙基或三氟甲基。

根據另一較佳實施例，R<sup>5</sup> 為除碳以外另具有 1、2、3 或 4 個氮原子作為環原子之 5 員雜芳基；或除碳以外另具有 1 個選自由氧及硫組成之群之雜原子及視情況選用 1、2 或 3 個氮原子作為環原子之 5 員雜芳基或為具有 1、2、3 或 4 個氮原子作為環原子之 6 員雜芳基，其中 5 員及 6 員雜芳基可未經取代，或未經取代之雜芳基中之一些或所有氮原子可經上述類型之取代基 R<sup>a</sup> 置換，以使得雜芳基上所有取代基 R<sup>a</sup> 之總數通常為 1、2、3 或 4。氮環原子上之取代基詳言之為經由碳連接之基團 R<sup>a</sup> 且尤其為 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基。

在該實施例中，R<sup>5</sup> 較佳為視情況經取代之 2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、2-嘧啶基、4-嘧啶基或 5-嘧啶基，其中上述雜環基較佳為未經取代或具有 1、2 或 3 個取代基 R<sup>a</sup>。關於較佳及尤其較佳之基團，上文所述者適用。

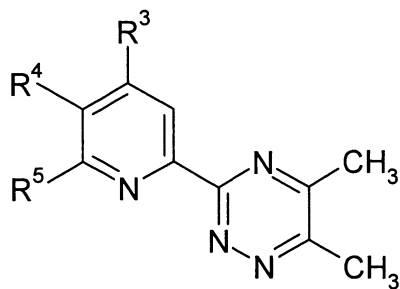
較佳雜芳族基團 R<sup>5</sup> 之實例為：

- 視情況經取代之 2-噻吩基，諸如未經取代之 2-噻吩基、5-甲基噻吩-2-基、4-甲基噻吩-2-基、5-氯噻吩-2-基、3-氰基噻吩-2-基、5-甲醯基噻吩-2-基、5-乙醯基噻吩-2-基、5-(甲氧基亞胺基甲基)噻吩-2-基、5-(1-(甲氧基亞胺基)乙基)噻吩-2-基、4-溴噻吩-2-基、3,5-二氯噻吩-2-基；
- 視情況經取代之 3-噻吩基，諸如未經取代之 3-噻吩基、

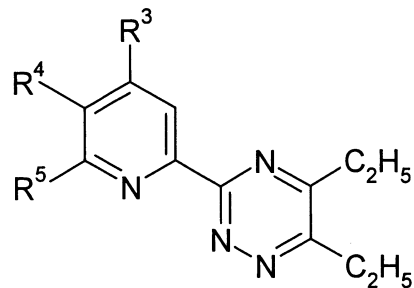
- 2-甲基噻吩-3-基、2,5-二氯噻吩-3-基、2,4,5-三氯噻吩-3-基；
- 視情況經取代之2-呋喃基，諸如未經取代之2-呋喃基、5-甲基呋喃-2-基、5-氯呋喃-2-基、4-甲基呋喃-2-基、3-氯基呋喃-2-基、5-乙醯基呋喃-2-基；
  - 視情況經取代之3-呋喃基，諸如未經取代之3-呋喃基、2-甲基呋喃-3-基、2,5-二甲基呋喃-3-基；
  - 視情況經取代之2-吡啶基，諸如未經取代之2-吡啶基、3-氟吡啶-2-基、3-氯吡啶-2-基、3-溴吡啶-2-基、3-三氟甲基-吡啶-2-基、3-甲基吡啶-2-基、3-乙基吡啶-2-基、3,5-二氟吡啶-2-基、3,5-二氯吡啶-2-基、3,5-二溴吡啶-2-基、3,5-二甲基吡啶-2-基、3-氟-5-三氟甲基吡啶-2-基、3-氯-5-氟吡啶-2-基、3-氯-5-甲基吡啶-2-基、3-氟-5-氯吡啶-2-基、3-氟-5-甲基吡啶-2-基、3-甲基-5-氟吡啶-2-基、3-甲基-5-氯吡啶-2-基、5-硝基吡啶-2-基、5-氯基吡啶-2-基、5-甲氧基羰基吡啶-2-基、5-三氟甲基吡啶-2-基、5-甲基吡啶-2-基、4-甲基吡啶-2-基、6-甲基吡啶-2-基；
  - 視情況經取代之3-吡啶基，諸如未經取代之3-吡啶基、2-氯吡啶-3-基、2-溴吡啶-3-基、2-甲基吡啶-3-基、2,4-二氯吡啶-3-基、2,4-二溴吡啶-3-基、2,4-二氟吡啶-3-基、2-氟-4-氯吡啶-3-基、2-氯-4-氟吡啶-3-基、2-氯-4-甲基吡啶-3-基、2-甲基-4-氟吡啶-3-基、2-甲基-4-氯吡啶-3-基、2,4-二甲基吡啶-3-基、2,4,6-三氯吡啶-3-基、

- 2,4,6-三溴吡啶-3-基、2,4,6-三甲基吡啶-3-基、2,4-二  
 氯-6-甲基吡啶-3-基、6-甲氧基吡啶-3-基、6-氯吡啶-3-  
 基；
- 視情況經取代之4-吡啶基，諸如未經取代之4-吡啶基、  
 3-氯吡啶-4-基、3-溴吡啶-4-基、3-甲基吡啶-4-基、3,5-  
 二氯吡啶-4-基、3,5-二溴-吡啶-4-基、3,5-二甲基吡啶-  
 4-基；
  - 視情況經取代之4-嘧啶基，諸如未經取代之4-嘧啶基、  
 5-氯嘧啶-4-基、5-氟嘧啶-4-基、5-氟-6-氯嘧啶-4-基、  
 2-甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基、2,5-二甲基-6-三氟甲基  
 嘧啶-4-基、5-甲基-6-三氟甲基-嘧啶-4-基、6-三氟甲基  
 嘧啶-4-基、2-甲基-5-氟嘧啶-4-基、2-甲基-5-氯嘧啶-4-  
 基、5-氯-6-甲基-嘧啶-4-基、5-氯-6-乙基嘧啶-4-基、5-  
 氯-6-異丙基嘧啶-4-基、5-溴-6-甲基嘧啶-4-基、5-氟-6-  
 甲基嘧啶-4-基、5-氟-6-氟甲基嘧啶-4-基、2,6-二甲基-  
 5-氯嘧啶-4-基、5,6-二甲基-嘧啶-4-基、2,5-二甲基嘧  
 啶-4-基、2,5,6-三甲基嘧啶-4-基、5-甲基-6-甲氧基嘧  
 啶-4-基；
  - 視情況經取代之5-嘧啶基，諸如未經取代之5-嘧啶基、  
 4-甲基嘧啶-5-基、4,6-二甲基嘧啶-5-基、2,4,6-三甲基  
 嘧啶-5-基、4-三氟甲基-6-甲基嘧啶-5-基；
  - 視情況經取代之2-嘧啶基，諸如未經取代之2-嘧啶基、  
 4,6-二甲基嘧啶-2-基、4,5,6-三甲基嘧啶-2-基、4,6-二  
 三氟甲基嘧啶-2-基及4,6-二甲基-5-氯嘧啶-2-基。

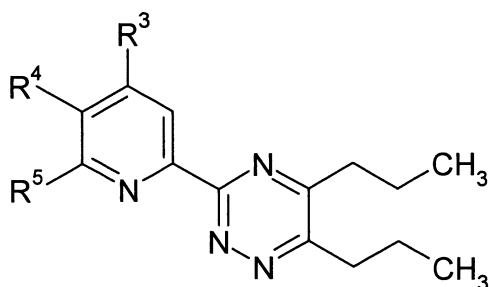
尤其較佳者為式I化合物之以下基團：



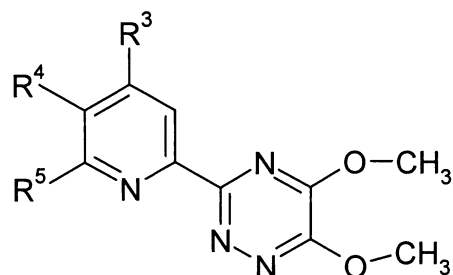
I.1



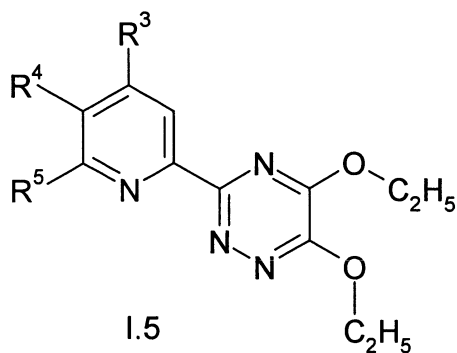
I.2



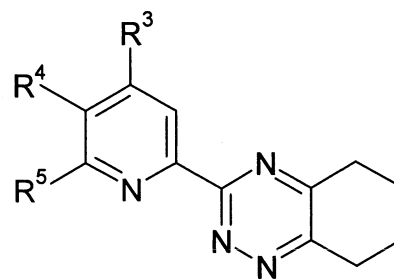
I.3



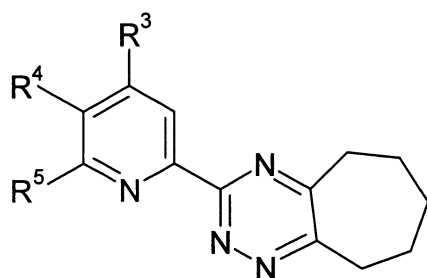
I.4



I.5



I.6



I.7

詳言之，就其用途而言，較佳為表1至9中提及之通式

I.1、I.2、I.3、I.4、I.5、I.6及I.7之化合物。

表 1

式I.1、I.2、I.3、I.4、I.5、I.6及I.7之化合物，其中化合物之 $R^3$ 為氫且 $R^4$ 與 $R^5$ 之組合於各情況下對應於表A中之一列。

表 2

式I.1、I.2、I.3、I.4、I.5、I.6及I.7之化合物，其中化合物之 $R^3$ 為甲基且 $R^4$ 與 $R^5$ 之組合於各情況下對應於表A中之一列。

表 3

式I.1、I.2、I.3、I.4、I.5、I.6及I.7之化合物，其中化合物之 $R^3$ 為乙基且 $R^4$ 與 $R^5$ 之組合於各情況下對應於表A中之一列。

表 4

式I.1、I.2、I.3、I.4、I.5、I.6及I.7之化合物，其中化合物之 $R^3$ 為甲氧基且 $R^4$ 與 $R^5$ 之組合於各情況下對應於表A中之一列。

表 5

式I.1、I.2、I.3、I.4、I.5、I.6及I.7之化合物，其中化合物之 $R^3$ 為乙氧基且 $R^4$ 與 $R^5$ 之組合於各情況下對應於表A中之一列。

表 6

式I.1、I.2、I.3、I.4、I.5、I.6及I.7之化合物，其中化合物之 $R^3$ 為異丙基且 $R^4$ 與 $R^5$ 之組合於各情況下對應於表A中

之一列。

表 7

式 I.1、I.2、I.3、I.4、I.5、I.6 及 I.7 之化合物，其中化合物之  $R^3$  為第三丁基且  $R^4$  與  $R^5$  之組合於各情況下對應於表 A 中之一列。

表 8

式 I.1、I.2、I.3、I.4、I.5、I.6 及 I.7 之化合物，其中化合物之  $R^3$  為三氟甲基且  $R^4$  與  $R^5$  之組合於各情況下對應於表 A 中之一列。

表 9

式 I.1、I.2、I.3、I.4、I.5、I.6 及 I.7 之化合物，其中化合物之  $R^3$  為二氟甲氧基且  $R^4$  與  $R^5$  之組合於各情況下對應於表 A 中之一列。

表 A

序號	$R^4$	$R^5$
A-1.	H	苯基
A-2.	H	2-氟苯基
A-3.	H	3-氟苯基
A-4.	H	4-氟苯基
A-5.	H	2-氯苯基
A-6.	H	3-氯苯基
A-7.	H	4-氯苯基
A-8.	H	3-溴苯基
A-9.	H	4-溴苯基
A-10.	H	2-三氟甲基苯基
A-11.	H	3-三氟甲基苯基
A-12.	H	4-三氟甲基苯基
A-13.	H	2-(甲硫基)苯基
A-14.	H	3-(甲硫基)苯基
A-15.	H	4-(甲硫基)苯基
A-16.	H	2-甲氧基苯基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-17.	H	3-甲氧基苯基
A-18.	H	4-甲氧基苯基
A-19.	H	4-硝基苯基
A-20.	H	4-氟基苯基
A-21.	H	4-第三丁基苯基
A-22.	H	4-異丙基苯基
A-23.	H	3-乙氧基苯基
A-24.	H	4-乙氧基苯基
A-25.	H	4-正丙氧基苯基
A-26.	H	3-異丙氧基苯基
A-27.	H	4-異丙氧基苯基
A-28.	H	4-正丁氧基苯基
A-29.	H	4-第三丁氧基苯基
A-30.	H	4-(甲氧基亞胺基甲基)苯基
A-31.	H	4-(1-(甲氧基亞胺基)乙基)苯基
A-32.	H	2,3-二氟苯基
A-33.	H	2,4-二氟苯基
A-34.	H	2,5-二氟苯基
A-35.	H	3,4-二氟苯基
A-36.	H	3,5-二氟苯基
A-37.	H	2,6-二氟苯基
A-38.	H	2,4,6-三氟苯基
A-39.	H	2,4,5-三氟苯基
A-40.	H	2,3,4-三氟苯基
A-41.	H	2,3,5-三氟苯基
A-42.	H	3,4,5-三氟苯基
A-43.	H	2,3-二氯苯基
A-44.	H	2,5-二氯苯基
A-45.	H	3,5-二氯苯基
A-46.	H	2,6-二氯苯基
A-47.	H	2,3-二甲基苯基
A-48.	H	2,4-二甲基苯基
A-49.	H	2,5-二甲基苯基
A-50.	H	2,4,5-三甲基苯基
A-51.	H	2,3-二甲氧基苯基
A-52.	H	2,4-二甲氧基苯基
A-53.	H	3,4-二甲氧基苯基
A-54.	H	2,4-雙(三氟甲基)苯基
A-55.	H	3,5-雙(三氟甲基)苯基
A-56.	H	2-甲基-3-甲氧基苯基
A-57.	H	2-甲基-4-甲氧基苯基
A-58.	H	2-甲基-6-甲氧基苯基
A-59.	H	3-氯-4-氟苯基



序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-60.	H	2-氯-4-氟苯基
A-61.	H	2-氯-6-氟苯基
A-62.	H	4-氯-2-氟苯基
A-63.	H	5-氯-2-氟苯基
A-64.	H	4-氟-3-甲基苯基
A-65.	H	2-氟-4-甲基苯基
A-66.	H	4-氟-2-甲基苯基
A-67.	H	2-氟-3-甲氧基苯基
A-68.	H	2-氟-4-甲氧基苯基
A-69.	H	2-氟-6-甲氧基苯基
A-70.	H	2-氟-4-三氟甲基苯基
A-71.	H	4-氯-3-甲基苯基
A-72.	H	2-氯-4-甲基苯基
A-73.	H	2-氯-6-甲基苯基
A-74.	H	5-氯-2-甲基苯基
A-75.	H	3-氯-2-甲基苯基
A-76.	H	2-氯-4-甲氧基苯基
A-77.	H	2-氯-6-甲氧基苯基
A-78.	H	2-氯-4-三氟甲基苯基
A-79.	H	3-氟-4-甲基苯基
A-80.	H	3-氟-4-異丙基苯基
A-81.	H	4-氟-3-甲基苯基
A-82.	H	3-氟-4-甲氧基苯基
A-83.	H	3-氟-4-乙氧基苯基
A-84.	H	3-氟-4-三氟甲基苯基
A-85.	H	3-氯-4-甲基苯基
A-86.	H	3-氯-4-甲氧基苯基
A-87.	H	3-氯-4-乙氧基苯基
A-88.	H	3-氯-4-三氟甲基苯基
A-89.	H	3-甲基-4-甲氧基苯基
A-90.	H	4-氯-2,5-二氟苯基
A-91.	H	4-第三丁基-2-氟苯基
A-92.	H	2-氟-4-異丙基苯基
A-93.	H	4-乙氧基-2-氟苯基
A-94.	H	4-乙醯基-2-氟苯基
A-95.	H	2-噻吩基
A-96.	H	5-甲基噻吩-2-基
A-97.	H	4-甲基噻吩-2-基
A-98.	H	5-氯噻吩-2-基
A-99.	H	3-氟基噻吩-2-基
A-100.	H	5-甲醯基噻吩-2-基
A-101.	H	5-乙醯基噻吩-2-基
A-102.	H	5-(甲氧基亞胺基甲基)噻吩-2-基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-103.	H	5-(1-(甲氧基亞胺基)乙基)噻吩-2-基
A-104.	H	4-溴噻吩-2-基
A-105.	H	3,5-二氯噻吩-2-基
A-106.	H	3-噻吩基
A-107.	H	2-甲基噻吩-3-基
A-108.	H	2,5-二氯噻吩-3-基
A-109.	H	2,4,5-三氯-噻吩-3-基
A-110.	H	2-呋喃基
A-111.	H	5-甲基呋喃-2-基
A-112.	H	5-氯呋喃-2-基
A-113.	H	4-甲基呋喃-2-基
A-114.	H	3-氯基呋喃-2-基
A-115.	H	5-乙醯基呋喃-2-基
A-116.	H	3-呋喃基
A-117.	H	2-甲基呋喃-3-基
A-118.	H	2,5-二甲基呋喃-3-基
A-119.	H	2-吡啶基
A-120.	H	3-氯吡啶-2-基
A-121.	H	3-氯吡啶-2-基
A-122.	H	3-溴吡啶-2-基
A-123.	H	3-三氯甲基吡啶-2-基
A-124.	H	3-甲基吡啶-2-基
A-125.	H	3-乙基吡啶-2-基
A-126.	H	3,5-二氯吡啶-2-基
A-127.	H	3,5-二氯吡啶-2-基
A-128.	H	3,5-二溴吡啶-2-基
A-129.	H	3,5-二甲基吡啶-2-基
A-130.	H	3-氯-5-三氯甲基吡啶-2-基
A-131.	H	3-氯-5-氯吡啶-2-基
A-132.	H	3-氯-5-甲基吡啶-2-基
A-133.	H	3-氯-5-氯吡啶-2-基
A-134.	H	3-氯-5-甲基吡啶-2-基
A-135.	H	3-甲基-5-氯吡啶-2-基
A-136.	H	3-甲基-5-氯吡啶-2-基
A-137.	H	5-硝基吡啶-2-基
A-138.	H	5-氯基吡啶-2-基
A-139.	H	5-甲氧羰基吡啶-2-基
A-140.	H	5-三氯甲基吡啶-2-基
A-141.	H	5-甲基吡啶-2-基
A-142.	H	4-甲基吡啶-2-基
A-143.	H	6-甲基吡啶-2-基
A-144.	H	3-吡啶基
A-145.	H	2-氯吡啶-3-基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-146.	H	2-溴吡啶-3-基
A-147.	H	2-甲基吡啶-3-基
A-148.	H	2,4-二氯吡啶-3-基
A-149.	H	2,4-二溴吡啶-3-基
A-150.	H	2,4-二氟吡啶-3-基
A-151.	H	2-氟-4-氯吡啶-3-基
A-152.	H	2-氯-4-氟吡啶-3-基
A-153.	H	2-氯-4-甲基吡啶-3-基
A-154.	H	2-甲基-4-氟吡啶-3-基
A-155.	H	2-甲基-4-氯吡啶-3-基
A-156.	H	2,4-二甲基吡啶-3-基
A-157.	H	2,4,6-三氯吡啶-3-基
A-158.	H	2,4,6-三溴吡啶-3-基
A-159.	H	2,4,6-三甲基吡啶-3-基
A-160.	H	2,4-二氯-6-甲基吡啶-3-基
A-161.	H	4-吡啶基
A-162.	H	3-氯吡啶-4-基
A-163.	H	3-溴吡啶-4-基
A-164.	H	3-甲基吡啶-4-基
A-165.	H	3,5-二氯吡啶-4-基
A-166.	H	3,5-二溴吡啶-4-基
A-167.	H	3,5-二甲基吡啶-4-基
A-168.	H	4-嘧啶基
A-169.	H	5-氯嘧啶-4-基
A-170.	H	5-氟嘧啶-4-基
A-171.	H	5-氟-6-氯嘧啶-4-基
A-172.	H	2-甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-173.	H	2,5-二甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-174.	H	5-甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-175.	H	6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-176.	H	2-甲基-5-氟嘧啶-4-基
A-177.	H	2-甲基-5-氯嘧啶-4-基
A-178.	H	5-氯-6-甲基嘧啶-4-基
A-179.	H	5-氯-6-乙基嘧啶-4-基
A-180.	H	5-氯-6-異丙基嘧啶-4-基
A-181.	H	5-溴-6-甲基嘧啶-4-基
A-182.	H	5-氟-6-甲基嘧啶-4-基
A-183.	H	5-氟-6-氟甲基嘧啶-4-基
A-184.	H	2,6-二甲基-5-氯嘧啶-4-基
A-185.	H	5,6-二甲基嘧啶-4-基
A-186.	H	2,5-二甲基嘧啶-4-基
A-187.	H	2,5,6-三甲基嘧啶-4-基
A-188.	H	5-甲基-6-甲氧基嘧啶-4-基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-189.	H	5-嘧啶基
A-190.	H	4-甲基嘧啶-5-基
A-191.	H	4,6-二甲基嘧啶-5-基
A-192.	H	2,4,6-三甲基嘧啶-5-基
A-193.	H	4-三氟甲基-6-甲基嘧啶-5-基
A-194.	H	2-嘧啶基
A-195.	H	4,6-二甲基嘧啶-2-基
A-196.	H	4,5,6-三甲基嘧啶-2-基
A-197.	H	4,6-二三氟甲基嘧啶-2-基
A-198.	H	4,6-二甲基-5-氯嘧啶-2-基
A-199.	CH <sub>3</sub>	苯基
A-200.	CH <sub>3</sub>	2-氟苯基
A-201.	CH <sub>3</sub>	3-氟苯基
A-202.	CH <sub>3</sub>	4-氟苯基
A-203.	CH <sub>3</sub>	2-氯苯基
A-204.	CH <sub>3</sub>	3-氯苯基
A-205.	CH <sub>3</sub>	4-氯苯基
A-206.	CH <sub>3</sub>	3-溴苯基
A-207.	CH <sub>3</sub>	4-溴苯基
A-208.	CH <sub>3</sub>	2-三氟甲基苯基
A-209.	CH <sub>3</sub>	3-三氟甲基苯基
A-210.	CH <sub>3</sub>	4-三氟甲基苯基
A-211.	CH <sub>3</sub>	2-(甲硫基)苯基
A-212.	CH <sub>3</sub>	3-(甲硫基)苯基
A-213.	CH <sub>3</sub>	4-(甲硫基)苯基
A-214.	CH <sub>3</sub>	2-甲氧基苯基
A-215.	CH <sub>3</sub>	3-甲氧基苯基
A-216.	CH <sub>3</sub>	4-甲氧基苯基
A-217.	CH <sub>3</sub>	4-硝基苯基
A-218.	CH <sub>3</sub>	4-氟基苯基
A-219.	CH <sub>3</sub>	4-第三丁基苯基
A-220.	CH <sub>3</sub>	4-異丙基苯基
A-221.	CH <sub>3</sub>	3-乙氧基苯基
A-222.	CH <sub>3</sub>	4-乙氧基苯基
A-223.	CH <sub>3</sub>	4-正丙氧基苯基
A-224.	CH <sub>3</sub>	3-異丙氧基苯基
A-225.	CH <sub>3</sub>	4-異丙氧基苯基
A-226.	CH <sub>3</sub>	4-正丁氧基苯基
A-227.	CH <sub>3</sub>	4-第三丁氧基苯基
A-228.	CH <sub>3</sub>	4-(甲氧基亞胺基甲基)苯基
A-229.	CH <sub>3</sub>	4-(1-(甲氧基亞胺基)乙基)苯基
A-230.	CH <sub>3</sub>	2,3-二氟苯基
A-231.	CH <sub>3</sub>	2,4-二氟苯基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-232.	CH <sub>3</sub>	2,5-二氟苯基
A-233.	CH <sub>3</sub>	3,4-二氟苯基
A-234.	CH <sub>3</sub>	3,5-二氟苯基
A-235.	CH <sub>3</sub>	2,6-二氟苯基
A-236.	CH <sub>3</sub>	2,4,6-三氟苯基
A-237.	CH <sub>3</sub>	2,4,5-三氟苯基
A-238.	CH <sub>3</sub>	2,3,4-三氟苯基
A-239.	CH <sub>3</sub>	2,3,5-三氟苯基
A-240.	CH <sub>3</sub>	3,4,5-三氟苯基
A-241.	CH <sub>3</sub>	2,3-二氯苯基
A-242.	CH <sub>3</sub>	2,5-二氯苯基
A-243.	CH <sub>3</sub>	3,5-二氯苯基
A-244.	CH <sub>3</sub>	2,6-二氯苯基
A-245.	CH <sub>3</sub>	2,3-二甲基苯基
A-246.	CH <sub>3</sub>	2,4-二甲基苯基
A-247.	CH <sub>3</sub>	2,5-二甲基苯基
A-248.	CH <sub>3</sub>	2,4,5-三甲基苯基
A-249.	CH <sub>3</sub>	2,3-二甲氧基苯基
A-250.	CH <sub>3</sub>	2,4-二甲氧基苯基
A-251.	CH <sub>3</sub>	3,4-二甲氧基苯基
A-252.	CH <sub>3</sub>	2,4-雙(三氟甲基)苯基
A-253.	CH <sub>3</sub>	3,5-雙(三氟甲基)苯基
A-254.	CH <sub>3</sub>	2-甲基-3-甲氧基苯基
A-255.	CH <sub>3</sub>	2-甲基-4-甲氧基苯基
A-256.	CH <sub>3</sub>	2-甲基-6-甲氧基苯基
A-257.	CH <sub>3</sub>	3-氯-4-氟苯基
A-258.	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-氟苯基
A-259.	CH <sub>3</sub>	2-氯-6-氟苯基
A-260.	CH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
A-261.	CH <sub>3</sub>	5-氯-2-氟苯基
A-262.	CH <sub>3</sub>	4-氟-3-甲基苯基
A-263.	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-甲基苯基
A-264.	CH <sub>3</sub>	4-氟-2-甲基苯基
A-265.	CH <sub>3</sub>	2-氟-3-甲氧基苯基
A-266.	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-甲氧基苯基
A-267.	CH <sub>3</sub>	2-氟-6-甲氧基苯基
A-268.	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-三氟甲基苯基
A-269.	CH <sub>3</sub>	4-氯-3-甲基苯基
A-270.	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-甲基苯基
A-271.	CH <sub>3</sub>	2-氯-6-甲基苯基
A-272.	CH <sub>3</sub>	5-氯-2-甲基苯基
A-273.	CH <sub>3</sub>	3-氯-2-甲基苯基
A-274.	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-甲氧基苯基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-275.	CH <sub>3</sub>	2-氯-6-甲氧基苯基
A-276.	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-三氟甲基苯基
A-277.	CH <sub>3</sub>	3-氟-4-甲基苯基
A-278.	CH <sub>3</sub>	3-氟-4-異丙基苯基
A-279.	CH <sub>3</sub>	4-氟-3-甲基苯基
A-280.	CH <sub>3</sub>	3-氟-4-甲氧基苯基
A-281.	CH <sub>3</sub>	3-氟-4-乙氧基苯基
A-282.	CH <sub>3</sub>	3-氟-4-三氟甲基苯基
A-283.	CH <sub>3</sub>	3-氟-4-甲基苯基
A-284.	CH <sub>3</sub>	3-氟-4-甲氧基苯基
A-285.	CH <sub>3</sub>	3-氟-4-乙氧基苯基
A-286.	CH <sub>3</sub>	3-氟-4-三氟甲基苯基
A-287.	CH <sub>3</sub>	3-甲基-4-甲氧基苯基
A-288.	CH <sub>3</sub>	4-氯-2,5-二氟苯基
A-289.	CH <sub>3</sub>	4-第三丁基-2-氟苯基
A-290.	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-異丙基苯基
A-291.	CH <sub>3</sub>	4-乙氧基-2-氟苯基
A-292.	CH <sub>3</sub>	4-乙醯基-2-氟苯基
A-293.	CH <sub>3</sub>	2-噻吩基
A-294.	CH <sub>3</sub>	5-甲基噻吩-2-基
A-295.	CH <sub>3</sub>	4-甲基噻吩-2-基
A-296.	CH <sub>3</sub>	5-氯噻吩-2-基
A-297.	CH <sub>3</sub>	3-氯基噻吩-2-基
A-298.	CH <sub>3</sub>	5-甲醯基噻吩-2-基
A-299.	CH <sub>3</sub>	5-乙醯基噻吩-2-基
A-300.	CH <sub>3</sub>	5-(甲氧基亞胺基甲基)噻吩-2-基
A-301.	CH <sub>3</sub>	5-(1-(甲氧基亞胺基)乙基)噻吩-2-基
A-302.	CH <sub>3</sub>	4-溴噻吩-2-基
A-303.	CH <sub>3</sub>	3,5-二氯噻吩-2-基
A-304.	CH <sub>3</sub>	3-噻吩基
A-305.	CH <sub>3</sub>	2-甲基噻吩-3-基
A-306.	CH <sub>3</sub>	2,5-二氯噻吩-3-基
A-307.	CH <sub>3</sub>	2,4,5-三氯噻吩-3-基
A-308.	CH <sub>3</sub>	2-咪喃基
A-309.	CH <sub>3</sub>	5-甲基咪喃-2-基
A-310.	CH <sub>3</sub>	5-氯咪喃-2-基
A-311.	CH <sub>3</sub>	4-甲基咪喃-2-基
A-312.	CH <sub>3</sub>	3-氯基咪喃-2-基
A-313.	CH <sub>3</sub>	5-乙醯基咪喃-2-基
A-314.	CH <sub>3</sub>	3-咪喃基
A-315.	CH <sub>3</sub>	2-甲基咪喃-3-基
A-316.	CH <sub>3</sub>	2,5-二甲基咪喃-3-基
A-317.	CH <sub>3</sub>	2-吡啶基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-318.	CH <sub>3</sub>	3-氟吡啶-2-基
A-319.	CH <sub>3</sub>	3-氯吡啶-2-基
A-320.	CH <sub>3</sub>	3-溴吡啶-2-基
A-321.	CH <sub>3</sub>	3-三氟甲基吡啶-2-基
A-322.	CH <sub>3</sub>	3-甲基吡啶-2-基
A-323.	CH <sub>3</sub>	3-乙基吡啶-2-基
A-324.	CH <sub>3</sub>	3,5-二氟吡啶-2-基
A-325.	CH <sub>3</sub>	3,5-二氯吡啶-2-基
A-326.	CH <sub>3</sub>	3,5-二溴吡啶-2-基
A-327.	CH <sub>3</sub>	3,5-二甲基吡啶-2-基
A-328.	CH <sub>3</sub>	3-氟-5-三氟甲基吡啶-2-基
A-329.	CH <sub>3</sub>	3-氟-5-氯吡啶-2-基
A-330.	CH <sub>3</sub>	3-氟-5-甲基吡啶-2-基
A-331.	CH <sub>3</sub>	3-氟-5-氯吡啶-2-基
A-332.	CH <sub>3</sub>	3-氟-5-甲基吡啶-2-基
A-333.	CH <sub>3</sub>	3-甲基-5-氟吡啶-2-基
A-334.	CH <sub>3</sub>	3-甲基-5-氯吡啶-2-基
A-335.	CH <sub>3</sub>	5-硝基吡啶-2-基
A-336.	CH <sub>3</sub>	5-氟基吡啶-2-基
A-337.	CH <sub>3</sub>	5-甲氧羰基吡啶-2-基
A-338.	CH <sub>3</sub>	5-三氟甲基吡啶-2-基
A-339.	CH <sub>3</sub>	5-甲基吡啶-2-基
A-340.	CH <sub>3</sub>	4-甲基吡啶-2-基
A-341.	CH <sub>3</sub>	6-甲基吡啶-2-基
A-342.	CH <sub>3</sub>	3-吡啶基
A-343.	CH <sub>3</sub>	2-氯吡啶-3-基
A-344.	CH <sub>3</sub>	2-溴吡啶-3-基
A-345.	CH <sub>3</sub>	2-甲基吡啶-3-基
A-346.	CH <sub>3</sub>	2,4-二氯吡啶-3-基
A-347.	CH <sub>3</sub>	2,4-二溴吡啶-3-基
A-348.	CH <sub>3</sub>	2,4-二氟吡啶-3-基
A-349.	CH <sub>3</sub>	2-氟-4-氯吡啶-3-基
A-350.	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-氟吡啶-3-基
A-351.	CH <sub>3</sub>	2-氯-4-甲基吡啶-3-基
A-352.	CH <sub>3</sub>	2-甲基-4-氟吡啶-3-基
A-353.	CH <sub>3</sub>	2-甲基-4-氯吡啶-3-基
A-354.	CH <sub>3</sub>	2,4-二甲基吡啶-3-基
A-355.	CH <sub>3</sub>	2,4,6-三氯吡啶-3-基
A-356.	CH <sub>3</sub>	2,4,6-三溴吡啶-3-基
A-357.	CH <sub>3</sub>	2,4,6-三甲基吡啶-3-基
A-358.	CH <sub>3</sub>	2,4-二氯-6-甲基吡啶-3-基
A-359.	CH <sub>3</sub>	4-吡啶基
A-360.	CH <sub>3</sub>	3-氯吡啶-4-基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-361.	CH <sub>3</sub>	3-溴吡啶-4-基
A-362.	CH <sub>3</sub>	3-甲基吡啶-4-基
A-363.	CH <sub>3</sub>	3,5-二氯吡啶-4-基
A-364.	CH <sub>3</sub>	3,5-二溴吡啶-4-基
A-365.	CH <sub>3</sub>	3,5-二甲基吡啶-4-基
A-366.	CH <sub>3</sub>	4-嘧啶基
A-367.	CH <sub>3</sub>	5-氯嘧啶-4-基
A-368.	CH <sub>3</sub>	5-氟嘧啶-4-基
A-369.	CH <sub>3</sub>	5-氯-6-氯嘧啶-4-基
A-370.	CH <sub>3</sub>	2-甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-371.	CH <sub>3</sub>	2,5-二甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-372.	CH <sub>3</sub>	5-甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-373.	CH <sub>3</sub>	6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-374.	CH <sub>3</sub>	2-甲基-5-氟嘧啶-4-基
A-375.	CH <sub>3</sub>	2-甲基-5-氯嘧啶-4-基
A-376.	CH <sub>3</sub>	5-氯-6-甲基嘧啶-4-基
A-377.	CH <sub>3</sub>	5-氯-6-乙基嘧啶-4-基
A-378.	CH <sub>3</sub>	5-氯-6-異丙基嘧啶-4-基
A-379.	CH <sub>3</sub>	5-溴-6-甲基嘧啶-4-基
A-380.	CH <sub>3</sub>	5-氟-6-甲基嘧啶-4-基
A-381.	CH <sub>3</sub>	5-氯-6-氟甲基嘧啶-4-基
A-382.	CH <sub>3</sub>	2,6-二甲基-5-氯嘧啶-4-基
A-383.	CH <sub>3</sub>	5,6-二甲基嘧啶-4-基
A-384.	CH <sub>3</sub>	2,5-二甲基嘧啶-4-基
A-385.	CH <sub>3</sub>	2,5,6-三甲基嘧啶-4-基
A-386.	CH <sub>3</sub>	5-甲基-6-甲氧基嘧啶-4-基
A-387.	CH <sub>3</sub>	5-嘧啶基
A-388.	CH <sub>3</sub>	4-甲基嘧啶-5-基
A-389.	CH <sub>3</sub>	4,6-二甲基嘧啶-5-基
A-390.	CH <sub>3</sub>	2,4,6-三甲基嘧啶-5-基
A-391.	CH <sub>3</sub>	4-三氟甲基-6-甲基嘧啶-5-基
A-392.	CH <sub>3</sub>	2-嘧啶基
A-393.	CH <sub>3</sub>	4,6-二甲基嘧啶-2-基
A-394.	CH <sub>3</sub>	4,5,6-三甲基嘧啶-2-基
A-395.	CH <sub>3</sub>	4,6-二三氟甲基嘧啶-2-基
A-396.	CH <sub>3</sub>	4,6-二甲基-5-氯嘧啶-2-基
A-397.	CF <sub>3</sub>	苯基
A-398.	CF <sub>3</sub>	2-氟苯基
A-399.	CF <sub>3</sub>	3-氟苯基
A-400.	CF <sub>3</sub>	4-氟苯基
A-401.	CF <sub>3</sub>	2-氯苯基
A-402.	CF <sub>3</sub>	3-氯苯基
A-403.	CF <sub>3</sub>	4-氯苯基



序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-404.	CF <sub>3</sub>	3-溴苯基
A-405.	CF <sub>3</sub>	4-溴苯基
A-406.	CF <sub>3</sub>	2-三氟甲基苯基
A-407.	CF <sub>3</sub>	3-三氟甲基苯基
A-408.	CF <sub>3</sub>	4-三氟甲基苯基
A-409.	CF <sub>3</sub>	2-(甲硫基)苯基
A-410.	CF <sub>3</sub>	3-(甲硫基)苯基
A-411.	CF <sub>3</sub>	4-(甲硫基)苯基
A-412.	CF <sub>3</sub>	2-甲氧基苯基
A-413.	CF <sub>3</sub>	3-甲氧基苯基
A-414.	CF <sub>3</sub>	4-甲氧基苯基
A-415.	CF <sub>3</sub>	4-硝基苯基
A-416.	CF <sub>3</sub>	4-氟基苯基
A-417.	CF <sub>3</sub>	4-第三丁基苯基
A-418.	CF <sub>3</sub>	4-異丙基苯基
A-419.	CF <sub>3</sub>	3-乙氧基苯基
A-420.	CF <sub>3</sub>	4-乙氧基苯基
A-421.	CF <sub>3</sub>	4-正丙氧基苯基
A-422.	CF <sub>3</sub>	3-異丙氧基苯基
A-423.	CF <sub>3</sub>	4-異丙氧基苯基
A-424.	CF <sub>3</sub>	4-正丁氧基苯基
A-425.	CF <sub>3</sub>	4-第三丁氧基苯基
A-426.	CF <sub>3</sub>	4-(甲氧基亞胺基甲基)苯基
A-427.	CF <sub>3</sub>	4-(1-(甲氧基亞胺基)乙基)苯基
A-428.	CF <sub>3</sub>	2,3-二氟苯基
A-429.	CF <sub>3</sub>	2,4-二氟苯基
A-430.	CF <sub>3</sub>	2,5-二氟苯基
A-431.	CF <sub>3</sub>	3,4-二氟苯基
A-432.	CF <sub>3</sub>	3,5-二氟苯基
A-433.	CF <sub>3</sub>	2,6-二氟苯基
A-434.	CF <sub>3</sub>	2,4,6-三氟苯基
A-435.	CF <sub>3</sub>	2,4,5-三氟苯基
A-436.	CF <sub>3</sub>	2,3,4-三氟苯基
A-437.	CF <sub>3</sub>	2,3,5-三氟苯基
A-438.	CF <sub>3</sub>	3,4,5-三氟苯基
A-439.	CF <sub>3</sub>	2,3-二氯苯基
A-440.	CF <sub>3</sub>	2,5-二氯苯基
A-441.	CF <sub>3</sub>	3,5-二氯苯基
A-442.	CF <sub>3</sub>	2,6-二氯苯基
A-443.	CF <sub>3</sub>	2,3-二甲基苯基
A-444.	CF <sub>3</sub>	2,4-二甲基苯基
A-445.	CF <sub>3</sub>	2,5-二甲基苯基
A-446.	CF <sub>3</sub>	2,4,5-三甲基苯基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-447.	CF <sub>3</sub>	2,3-二甲氧基苯基
A-448.	CF <sub>3</sub>	2,4-二甲氧基苯基
A-449.	CF <sub>3</sub>	3,4-二甲氧基苯基
A-450.	CF <sub>3</sub>	2,4-雙(三氟甲基)苯基
A-451.	CF <sub>3</sub>	3,5-雙(三氟甲基)苯基
A-452.	CF <sub>3</sub>	2-甲基-3-甲氧基苯基
A-453.	CF <sub>3</sub>	2-甲基-4-甲氧基苯基
A-454.	CF <sub>3</sub>	2-甲基-6-甲氧基苯基
A-455.	CF <sub>3</sub>	3-氯-4-氟苯基
A-456.	CF <sub>3</sub>	2-氯-4-氟苯基
A-457.	CF <sub>3</sub>	2-氯-6-氟苯基
A-458.	CF <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
A-459.	CF <sub>3</sub>	5-氯-2-氟苯基
A-460.	CF <sub>3</sub>	4-氟-3-甲基苯基
A-461.	CF <sub>3</sub>	2-氟-4-甲基苯基
A-462.	CF <sub>3</sub>	4-氟-2-甲基苯基
A-463.	CF <sub>3</sub>	2-氟-3-甲氧基苯基
A-464.	CF <sub>3</sub>	2-氟-4-甲氧基苯基
A-465.	CF <sub>3</sub>	2-氟-6-甲氧基苯基
A-466.	CF <sub>3</sub>	2-氟-4-三氟甲基苯基
A-467.	CF <sub>3</sub>	4-氯-3-甲基苯基
A-468.	CF <sub>3</sub>	2-氯-4-甲基苯基
A-469.	CF <sub>3</sub>	2-氯-6-甲基苯基
A-470.	CF <sub>3</sub>	5-氯-2-甲基苯基
A-471.	CF <sub>3</sub>	3-氯-2-甲基苯基
A-472.	CF <sub>3</sub>	2-氯-4-甲氧基苯基
A-473.	CF <sub>3</sub>	2-氯-6-甲氧基苯基
A-474.	CF <sub>3</sub>	2-氯-4-三氟甲基苯基
A-475.	CF <sub>3</sub>	3-氟-4-甲基苯基
A-476.	CF <sub>3</sub>	3-氟-4-異丙基苯基
A-477.	CF <sub>3</sub>	4-氟-3-甲基苯基
A-478.	CF <sub>3</sub>	3-氟-4-甲氧基苯基
A-479.	CF <sub>3</sub>	3-氟-4-乙氧基苯基
A-480.	CF <sub>3</sub>	3-氟-4-三氟甲基苯基
A-481.	CF <sub>3</sub>	3-氯-4-甲基苯基
A-482.	CF <sub>3</sub>	3-氯-4-甲氧基苯基
A-483.	CF <sub>3</sub>	3-氯-4-乙氧基苯基
A-484.	CF <sub>3</sub>	3-氯-4-三氟甲基苯基
A-485.	CF <sub>3</sub>	3-甲基-4-甲氧基苯基
A-486.	CF <sub>3</sub>	4-氯-2,5-二氟苯基
A-487.	CF <sub>3</sub>	4-第三丁基-2-氟苯基
A-488.	CF <sub>3</sub>	2-氟-4-異丙基苯基
A-489.	CF <sub>3</sub>	4-乙氧基-2-氟苯基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-490.	CF <sub>3</sub>	4-乙醯基-2-氟苯基
A-491.	CF <sub>3</sub>	2-噻吩基
A-492.	CF <sub>3</sub>	5-甲基噻吩-2-基
A-493.	CF <sub>3</sub>	4-甲基噻吩-2-基
A-494.	CF <sub>3</sub>	5-氯噻吩-2-基
A-495.	CF <sub>3</sub>	3-氟基噻吩-2-基
A-496.	CF <sub>3</sub>	5-甲醯基噻吩-2-基
A-497.	CF <sub>3</sub>	5-乙醯基噻吩-2-基
A-498.	CF <sub>3</sub>	5-(甲氧基亞胺基甲基)噻吩-2-基
A-499.	CF <sub>3</sub>	5-(1-(甲氧基亞胺基)乙基)噻吩-2-基
A-500.	CF <sub>3</sub>	4-溴噻吩-2-基
A-501.	CF <sub>3</sub>	3,5-二氯噻吩-2-基
A-502.	CF <sub>3</sub>	3-噻吩基
A-503.	CF <sub>3</sub>	2-甲基噻吩-3-基
A-504.	CF <sub>3</sub>	2,5-二氯噻吩-3-基
A-505.	CF <sub>3</sub>	2,4,5-三氯噻吩-3-基
A-506.	CF <sub>3</sub>	2-呋喃基
A-507.	CF <sub>3</sub>	5-甲基呋喃-2-基
A-508.	CF <sub>3</sub>	5-氯呋喃-2-基
A-509.	CF <sub>3</sub>	4-甲基呋喃-2-基
A-510.	CF <sub>3</sub>	3-氟基呋喃-2-基
A-511.	CF <sub>3</sub>	5-乙醯基呋喃-2-基
A-512.	CF <sub>3</sub>	3-呋喃基
A-513.	CF <sub>3</sub>	2-甲基呋喃-3-基
A-514.	CF <sub>3</sub>	2,5-二甲基呋喃-3-基
A-515.	CF <sub>3</sub>	2-吡啶基
A-516.	CF <sub>3</sub>	3-氟吡啶-2-基
A-517.	CF <sub>3</sub>	3-氯吡啶-2-基
A-518.	CF <sub>3</sub>	3-溴吡啶-2-基
A-519.	CF <sub>3</sub>	3-三氟甲基吡啶-2-基
A-520.	CF <sub>3</sub>	3-甲基吡啶-2-基
A-521.	CF <sub>3</sub>	3-乙基吡啶-2-基
A-522.	CF <sub>3</sub>	3,5-二氯吡啶-2-基
A-523.	CF <sub>3</sub>	3,5-二氟吡啶-2-基
A-524.	CF <sub>3</sub>	3,5-二溴吡啶-2-基
A-525.	CF <sub>3</sub>	3,5-二甲基吡啶-2-基
A-526.	CF <sub>3</sub>	3-氟-5-三氟甲基吡啶-2-基
A-527.	CF <sub>3</sub>	3-氟-5-氯吡啶-2-基
A-528.	CF <sub>3</sub>	3-氟-5-甲基吡啶-2-基
A-529.	CF <sub>3</sub>	3-氟-5-氯吡啶-2-基
A-530.	CF <sub>3</sub>	3-氟-5-甲基吡啶-2-基
A-531.	CF <sub>3</sub>	3-甲基-5-氯吡啶-2-基
A-532.	CF <sub>3</sub>	3-甲基-5-氟吡啶-2-基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-533.	CF <sub>3</sub>	5-硝基吡啶-2-基
A-534.	CF <sub>3</sub>	5-氟基吡啶-2-基
A-535.	CF <sub>3</sub>	5-甲氧羰基吡啶-2-基
A-536.	CF <sub>3</sub>	5-三氟甲基吡啶-2-基
A-537.	CF <sub>3</sub>	5-甲基吡啶-2-基
A-538.	CF <sub>3</sub>	4-甲基吡啶-2-基
A-539.	CF <sub>3</sub>	6-甲基吡啶-2-基
A-540.	CF <sub>3</sub>	3-吡啶基
A-541.	CF <sub>3</sub>	2-氯吡啶-3-基
A-542.	CF <sub>3</sub>	2-溴吡啶-3-基
A-543.	CF <sub>3</sub>	2-甲基吡啶-3-基
A-544.	CF <sub>3</sub>	2,4-二氯吡啶-3-基
A-545.	CF <sub>3</sub>	2,4-二溴吡啶-3-基
A-546.	CF <sub>3</sub>	2,4-二氟吡啶-3-基
A-547.	CF <sub>3</sub>	2-氯-4-氯吡啶-3-基
A-548.	CF <sub>3</sub>	2-氯-4-氟吡啶-3-基
A-549.	CF <sub>3</sub>	2-氯-4-甲基吡啶-3-基
A-550.	CF <sub>3</sub>	2-甲基-4-氯吡啶-3-基
A-551.	CF <sub>3</sub>	2-甲基-4-氟吡啶-3-基
A-552.	CF <sub>3</sub>	2,4-二甲基吡啶-3-基
A-553.	CF <sub>3</sub>	2,4,6-三氯吡啶-3-基
A-554.	CF <sub>3</sub>	2,4,6-三溴吡啶-3-基
A-555.	CF <sub>3</sub>	2,4,6-三甲基吡啶-3-基
A-556.	CF <sub>3</sub>	2,4-二氯-6-甲基吡啶-3-基
A-557.	CF <sub>3</sub>	4-吡啶基
A-558.	CF <sub>3</sub>	3-氯吡啶-4-基
A-559.	CF <sub>3</sub>	3-溴吡啶-4-基
A-560.	CF <sub>3</sub>	3-甲基吡啶-4-基
A-561.	CF <sub>3</sub>	3,5-二氯吡啶-4-基
A-562.	CF <sub>3</sub>	3,5-二溴吡啶-4-基
A-563.	CF <sub>3</sub>	3,5-二甲基吡啶-4-基
A-564.	CF <sub>3</sub>	4-嘧啶基
A-565.	CF <sub>3</sub>	5-氯嘧啶-4-基
A-566.	CF <sub>3</sub>	5-氟嘧啶-4-基
A-567.	CF <sub>3</sub>	5-氯-6-氯嘧啶-4-基
A-568.	CF <sub>3</sub>	2-甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-569.	CF <sub>3</sub>	2,5-二甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-570.	CF <sub>3</sub>	5-甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-571.	CF <sub>3</sub>	6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-572.	CF <sub>3</sub>	2-甲基-5-氯嘧啶-4-基
A-573.	CF <sub>3</sub>	2-甲基-5-氟嘧啶-4-基
A-574.	CF <sub>3</sub>	5-氯-6-甲基嘧啶-4-基
A-575.	CF <sub>3</sub>	5-氯-6-乙基嘧啶-4-基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-576.	CF <sub>3</sub>	5-氯-6-異丙基嘧啶-4-基
A-577.	CF <sub>3</sub>	5-溴-6-甲基嘧啶-4-基
A-578.	CF <sub>3</sub>	5-氟-6-甲基嘧啶-4-基
A-579.	CF <sub>3</sub>	5-氟-6-氟甲基嘧啶-4-基
A-580.	CF <sub>3</sub>	2,6-二甲基-5-氯嘧啶-4-基
A-581.	CF <sub>3</sub>	5,6-二甲基嘧啶-4-基
A-582.	CF <sub>3</sub>	2,5-二甲基嘧啶-4-基
A-583.	CF <sub>3</sub>	2,5,6-三甲基嘧啶-4-基
A-584.	CF <sub>3</sub>	5-甲基-6-甲氧基嘧啶-4-基
A-585.	CF <sub>3</sub>	5-嘧啶基
A-586.	CF <sub>3</sub>	4-甲基嘧啶-5-基
A-587.	CF <sub>3</sub>	4,6-二甲基嘧啶-5-基
A-588.	CF <sub>3</sub>	2,4,6-三甲基嘧啶-5-基
A-589.	CF <sub>3</sub>	4-三氟甲基-6-甲基嘧啶-5-基
A-590.	CF <sub>3</sub>	2-嘧啶基
A-591.	CF <sub>3</sub>	4,6-二甲基嘧啶-2-基
A-592.	CF <sub>3</sub>	4,5,6-三甲基嘧啶-2-基
A-593.	CF <sub>3</sub>	4,6-二三氟甲基嘧啶-2-基
A-594.	CF <sub>3</sub>	4,6-二甲基-5-氯嘧啶-2-基
A-595.	OCH <sub>3</sub>	苯基
A-596.	OCH <sub>3</sub>	2-氟苯基
A-597.	OCH <sub>3</sub>	3-氟苯基
A-598.	OCH <sub>3</sub>	4-氟苯基
A-599.	OCH <sub>3</sub>	2-氯苯基
A-600.	OCH <sub>3</sub>	3-氯苯基
A-601.	OCH <sub>3</sub>	4-氯苯基
A-602.	OCH <sub>3</sub>	3-溴苯基
A-603.	OCH <sub>3</sub>	4-溴苯基
A-604.	OCH <sub>3</sub>	2-三氟甲基苯基
A-605.	OCH <sub>3</sub>	3-三氟甲基苯基
A-606.	OCH <sub>3</sub>	4-三氟甲基苯基
A-607.	OCH <sub>3</sub>	2-(甲硫基)苯基
A-608.	OCH <sub>3</sub>	3-(甲硫基)苯基
A-609.	OCH <sub>3</sub>	4-(甲硫基)苯基
A-610.	OCH <sub>3</sub>	2-甲氧基苯基
A-611.	OCH <sub>3</sub>	3-甲氧基苯基
A-612.	OCH <sub>3</sub>	4-甲氧基苯基
A-613.	OCH <sub>3</sub>	4-硝基苯基
A-614.	OCH <sub>3</sub>	4-氟基苯基
A-615.	OCH <sub>3</sub>	4-第三丁基苯基
A-616.	OCH <sub>3</sub>	4-異丙基苯基
A-617.	OCH <sub>3</sub>	3-乙氧基苯基
A-618.	OCH <sub>3</sub>	4-乙氧基苯基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-619.	OCH <sub>3</sub>	4-正丙氧基苯基
A-620.	OCH <sub>3</sub>	3-異丙氧基苯基
A-621.	OCH <sub>3</sub>	4-異丙氧基苯基
A-622.	OCH <sub>3</sub>	4-正丁氧基苯基
A-623.	OCH <sub>3</sub>	4-第三丁氧基苯基
A-624.	OCH <sub>3</sub>	4-(甲氧基亞胺基甲基)苯基
A-625.	OCH <sub>3</sub>	4-(1-(甲氧基亞胺基)乙基)苯基
A-626.	OCH <sub>3</sub>	2,3-二氟苯基
A-627.	OCH <sub>3</sub>	2,4-二氟苯基
A-628.	OCH <sub>3</sub>	2,5-二氟苯基
A-629.	OCH <sub>3</sub>	3,4-二氟苯基
A-630.	OCH <sub>3</sub>	3,5-二氟苯基
A-631.	OCH <sub>3</sub>	2,6-二氟苯基
A-632.	OCH <sub>3</sub>	2,4,6-三氟苯基
A-633.	OCH <sub>3</sub>	2,4,5-三氟苯基
A-634.	OCH <sub>3</sub>	2,3,4-三氟苯基
A-635.	OCH <sub>3</sub>	2,3,5-三氟苯基
A-636.	OCH <sub>3</sub>	3,4,5-三氟苯基
A-637.	OCH <sub>3</sub>	2,3-二氯苯基
A-638.	OCH <sub>3</sub>	2,5-二氯苯基
A-639.	OCH <sub>3</sub>	3,5-二氯苯基
A-640.	OCH <sub>3</sub>	2,6-二氯苯基
A-641.	OCH <sub>3</sub>	2,3-二甲基苯基
A-642.	OCH <sub>3</sub>	2,4-二甲基苯基
A-643.	OCH <sub>3</sub>	2,5-二甲基苯基
A-644.	OCH <sub>3</sub>	2,4,5-三甲基苯基
A-645.	OCH <sub>3</sub>	2,3-二甲氧基苯基
A-646.	OCH <sub>3</sub>	2,4-二甲氧基苯基
A-647.	OCH <sub>3</sub>	3,4-二甲氧基苯基
A-648.	OCH <sub>3</sub>	2,4-雙(三氟甲基)苯基
A-649.	OCH <sub>3</sub>	3,5-雙(三氟甲基)苯基
A-650.	OCH <sub>3</sub>	2-甲基-3-甲氧基苯基
A-651.	OCH <sub>3</sub>	2-甲基-4-甲氧基苯基
A-652.	OCH <sub>3</sub>	2-甲基-6-甲氧基苯基
A-653.	OCH <sub>3</sub>	3-氯-4-氟苯基
A-654.	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-氟苯基
A-655.	OCH <sub>3</sub>	2-氯-6-氟苯基
A-656.	OCH <sub>3</sub>	4-氯-2-氟苯基
A-657.	OCH <sub>3</sub>	5-氯-2-氟苯基
A-658.	OCH <sub>3</sub>	4-氟-3-甲基苯基
A-659.	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-甲基苯基
A-660.	OCH <sub>3</sub>	4-氟-2-甲基苯基
A-661.	OCH <sub>3</sub>	2-氟-3-甲氧基苯基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-662.	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-甲氧基苯基
A-663.	OCH <sub>3</sub>	2-氟-6-甲氧基苯基
A-664.	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-三氟甲基苯基
A-665.	OCH <sub>3</sub>	4-氟-3-甲基苯基
A-666.	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-甲基苯基
A-667.	OCH <sub>3</sub>	2-氟-6-甲基苯基
A-668.	OCH <sub>3</sub>	5-氟-2-甲基苯基
A-669.	OCH <sub>3</sub>	3-氟-2-甲基苯基
A-670.	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-甲氧基苯基
A-671.	OCH <sub>3</sub>	2-氟-6-甲氧基苯基
A-672.	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-三氟甲基苯基
A-673.	OCH <sub>3</sub>	3-氟-4-甲基苯基
A-674.	OCH <sub>3</sub>	3-氟-4-異丙基苯基
A-675.	OCH <sub>3</sub>	4-氟-3-甲基苯基
A-676.	OCH <sub>3</sub>	3-氟-4-甲氧基苯基
A-677.	OCH <sub>3</sub>	3-氟-4-乙氧基苯基
A-678.	OCH <sub>3</sub>	3-氟-4-三氟甲基苯基
A-679.	OCH <sub>3</sub>	3-氟-4-甲基苯基
A-680.	OCH <sub>3</sub>	3-氟-4-甲氧基苯基
A-681.	OCH <sub>3</sub>	3-氟-4-乙氧基苯基
A-682.	OCH <sub>3</sub>	3-氟-4-三氟甲基苯基
A-683.	OCH <sub>3</sub>	3-甲基-4-甲氧基苯基
A-684.	OCH <sub>3</sub>	4-氟-2,5-二氟苯基
A-685.	OCH <sub>3</sub>	4-第三丁基-2-氟苯基
A-686.	OCH <sub>3</sub>	2-氟-4-異丙基苯基
A-687.	OCH <sub>3</sub>	4-乙氧基-2-氟苯基
A-688.	OCH <sub>3</sub>	4-乙醯基-2-氟苯基
A-689.	OCH <sub>3</sub>	2-噻吩基
A-690.	OCH <sub>3</sub>	5-甲基噻吩-2-基
A-691.	OCH <sub>3</sub>	4-甲基噻吩-2-基
A-692.	OCH <sub>3</sub>	5-氟噻吩-2-基
A-693.	OCH <sub>3</sub>	3-氟基噻吩-2-基
A-694.	OCH <sub>3</sub>	5-甲醯基噻吩-2-基
A-695.	OCH <sub>3</sub>	5-乙醯基噻吩-2-基
A-696.	OCH <sub>3</sub>	5-(甲氧基亞胺基甲基)噻吩-2-基
A-697.	OCH <sub>3</sub>	5-(1-(甲氧基亞胺基)乙基)噻吩-2-基
A-698.	OCH <sub>3</sub>	4-溴噻吩-2-基
A-699.	OCH <sub>3</sub>	3,5-二氟噻吩-2-基
A-700.	OCH <sub>3</sub>	3-噻吩基
A-701.	OCH <sub>3</sub>	2-甲基噻吩-3-基
A-702.	OCH <sub>3</sub>	2,5-二氟噻吩-3-基
A-703.	OCH <sub>3</sub>	2,4,5-三氟-噻吩-3-基
A-704.	OCH <sub>3</sub>	2-呋喃基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-705.	OCH <sub>3</sub>	5-甲基咪喃-2-基
A-706.	OCH <sub>3</sub>	5-氯咪喃-2-基
A-707.	OCH <sub>3</sub>	4-甲基咪喃-2-基
A-708.	OCH <sub>3</sub>	3-氯基咪喃-2-基
A-709.	OCH <sub>3</sub>	5-乙醯基咪喃-2-基
A-710.	OCH <sub>3</sub>	3-咪喃基
A-711.	OCH <sub>3</sub>	2-甲基咪喃-3-基
A-712.	OCH <sub>3</sub>	2,5-二甲基咪喃-3-基
A-713.	OCH <sub>3</sub>	2-吡啶基
A-714.	OCH <sub>3</sub>	3-氯吡啶-2-基
A-715.	OCH <sub>3</sub>	3-氯吡啶-2-基
A-716.	OCH <sub>3</sub>	3-溴吡啶-2-基
A-717.	OCH <sub>3</sub>	3-三氟甲基吡啶-2-基
A-718.	OCH <sub>3</sub>	3-甲基吡啶-2-基
A-719.	OCH <sub>3</sub>	3-乙基吡啶-2-基
A-720.	OCH <sub>3</sub>	3,5-二氯吡啶-2-基
A-721.	OCH <sub>3</sub>	3,5-二氯吡啶-2-基
A-722.	OCH <sub>3</sub>	3,5-二溴吡啶-2-基
A-723.	OCH <sub>3</sub>	3,5-二甲基吡啶-2-基
A-724.	OCH <sub>3</sub>	3-氯-5-三氟甲基吡啶-2-基
A-725.	OCH <sub>3</sub>	3-氯-5-氯吡啶-2-基
A-726.	OCH <sub>3</sub>	3-氯-5-甲基吡啶-2-基
A-727.	OCH <sub>3</sub>	3-氯-5-氯吡啶-2-基
A-728.	OCH <sub>3</sub>	3-氯-5-甲基吡啶-2-基
A-729.	OCH <sub>3</sub>	3-甲基-5-氯吡啶-2-基
A-730.	OCH <sub>3</sub>	3-甲基-5-氯吡啶-2-基
A-731.	OCH <sub>3</sub>	5-硝基吡啶-2-基
A-732.	OCH <sub>3</sub>	5-氯基吡啶-2-基
A-733.	OCH <sub>3</sub>	5-甲氧羰基吡啶-2-基
A-734.	OCH <sub>3</sub>	5-三氟甲基吡啶-2-基
A-735.	OCH <sub>3</sub>	5-甲基吡啶-2-基
A-736.	OCH <sub>3</sub>	4-甲基吡啶-2-基
A-737.	OCH <sub>3</sub>	6-甲基吡啶-2-基
A-738.	OCH <sub>3</sub>	3-吡啶基
A-739.	OCH <sub>3</sub>	2-氯吡啶-3-基
A-740.	OCH <sub>3</sub>	2-溴吡啶-3-基
A-741.	OCH <sub>3</sub>	2-甲基吡啶-3-基
A-742.	OCH <sub>3</sub>	2,4-二氯吡啶-3-基
A-743.	OCH <sub>3</sub>	2,4-二溴吡啶-3-基
A-744.	OCH <sub>3</sub>	2,4-二氯吡啶-3-基
A-745.	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-氯吡啶-3-基
A-746.	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-氯吡啶-3-基
A-747.	OCH <sub>3</sub>	2-氯-4-甲基吡啶-3-基



序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-748.	OCH <sub>3</sub>	2-甲基-4-氟吡啶-3-基
A-749.	OCH <sub>3</sub>	2-甲基-4-氯吡啶-3-基
A-750.	OCH <sub>3</sub>	2,4-二甲基吡啶-3-基
A-751.	OCH <sub>3</sub>	2,4,6-三氯吡啶-3-基
A-752.	OCH <sub>3</sub>	2,4,6-三溴吡啶-3-基
A-753.	OCH <sub>3</sub>	2,4,6-三甲基吡啶-3-基
A-754.	OCH <sub>3</sub>	2,4-二氯-6-甲基吡啶-3-基
A-755.	OCH <sub>3</sub>	4-吡啶基
A-756.	OCH <sub>3</sub>	3-氯吡啶-4-基
A-757.	OCH <sub>3</sub>	3-溴吡啶-4-基
A-758.	OCH <sub>3</sub>	3-甲基吡啶-4-基
A-759.	OCH <sub>3</sub>	3,5-二氯吡啶-4-基
A-760.	OCH <sub>3</sub>	3,5-二溴吡啶-4-基
A-761.	OCH <sub>3</sub>	3,5-二甲基吡啶-4-基
A-762.	OCH <sub>3</sub>	4-嘧啶基
A-763.	OCH <sub>3</sub>	5-氯嘧啶-4-基
A-764.	OCH <sub>3</sub>	5-氟嘧啶-4-基
A-765.	OCH <sub>3</sub>	5-氯-6-氯嘧啶-4-基
A-766.	OCH <sub>3</sub>	2-甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-767.	OCH <sub>3</sub>	2,5-二甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-768.	OCH <sub>3</sub>	5-甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-769.	OCH <sub>3</sub>	6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-770.	OCH <sub>3</sub>	2-甲基-5-氯嘧啶-4-基
A-771.	OCH <sub>3</sub>	2-甲基-5-氟嘧啶-4-基
A-772.	OCH <sub>3</sub>	5-氯-6-甲基嘧啶-4-基
A-773.	OCH <sub>3</sub>	5-氯-6-乙基嘧啶-4-基
A-774.	OCH <sub>3</sub>	5-氯-6-異丙基嘧啶-4-基
A-775.	OCH <sub>3</sub>	5-溴-6-甲基嘧啶-4-基
A-776.	OCH <sub>3</sub>	5-氟-6-甲基嘧啶-4-基
A-777.	OCH <sub>3</sub>	5-氯-6-氟甲基嘧啶-4-基
A-778.	OCH <sub>3</sub>	2,6-二甲基-5-氯嘧啶-4-基
A-779.	OCH <sub>3</sub>	5,6-二甲基嘧啶-4-基
A-780.	OCH <sub>3</sub>	2,5-二甲基嘧啶-4-基
A-781.	OCH <sub>3</sub>	2,5,6-三甲基嘧啶-4-基
A-782.	OCH <sub>3</sub>	5-甲基-6-甲氧基嘧啶-4-基
A-783.	OCH <sub>3</sub>	5-嘧啶基
A-784.	OCH <sub>3</sub>	4-甲基嘧啶-5-基
A-785.	OCH <sub>3</sub>	4,6-二甲基嘧啶-5-基
A-786.	OCH <sub>3</sub>	2,4,6-三甲基嘧啶-5-基
A-787.	OCH <sub>3</sub>	4-三氟甲基-6-甲基嘧啶-5-基
A-788.	OCH <sub>3</sub>	2-嘧啶基
A-789.	OCH <sub>3</sub>	4,6-二甲基嘧啶-2-基
A-790.	OCH <sub>3</sub>	4,5,6-三甲基嘧啶-2-基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-791.	OCH <sub>3</sub>	4,6-二三氟甲基嘧啶-2-基
A-792.	OCH <sub>3</sub>	4,6-二甲基-5-氟嘧啶-2-基
A-793.	Cl	苯基
A-794.	Cl	2-氟苯基
A-795.	Cl	3-氟苯基
A-796.	Cl	4-氟苯基
A-797.	Cl	2-氯苯基
A-798.	Cl	3-氯苯基
A-799.	Cl	4-氯苯基
A-800.	Cl	3-溴苯基
A-801.	Cl	4-溴苯基
A-802.	Cl	2-三氟甲基苯基
A-803.	Cl	3-三氟甲基苯基
A-804.	Cl	4-三氟甲基苯基
A-805.	Cl	2-(甲硫基)苯基
A-806.	Cl	3-(甲硫基)苯基
A-807.	Cl	4-(甲硫基)苯基
A-808.	Cl	2-甲氧基苯基
A-809.	Cl	3-甲氧基苯基
A-810.	Cl	4-甲氧基苯基
A-811.	Cl	4-硝基苯基
A-812.	Cl	4-氟基苯基
A-813.	Cl	4-第三丁基苯基
A-814.	Cl	4-異丙基苯基
A-815.	Cl	3-乙氧基苯基
A-816.	Cl	4-乙氧基苯基
A-817.	Cl	4-正丙氧基苯基
A-818.	Cl	3-異丙氧基苯基
A-819.	Cl	4-異丙氧基苯基
A-820.	Cl	4-正丁氧基苯基
A-821.	Cl	4-第三丁氧基苯基
A-822.	Cl	4-(甲氧基亞胺基甲基)苯基
A-823.	Cl	4-(1-(甲氧基亞胺基)乙基)苯基
A-824.	Cl	2,3-二氟苯基
A-825.	Cl	2,4-二氟苯基
A-826.	Cl	2,5-二氟苯基
A-827.	Cl	3,4-二氟苯基
A-828.	Cl	3,5-二氟苯基
A-829.	Cl	2,6-二氟苯基
A-830.	Cl	2,4,6-三氟苯基
A-831.	Cl	2,4,5-三氟苯基
A-832.	Cl	2,3,4-三氟苯基
A-833.	Cl	2,3,5-三氟苯基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-834.	Cl	3,4,5-三氟苯基
A-835.	Cl	2,3-二氯苯基
A-836.	Cl	2,5-二氯苯基
A-837.	Cl	3,5-二氯苯基
A-838.	Cl	2,6-二氯苯基
A-839.	Cl	2,3-二甲基苯基
A-840.	Cl	2,4-二甲基苯基
A-841.	Cl	2,5-二甲基苯基
A-842.	Cl	2,4,5-三甲基苯基
A-843.	Cl	2,3-二甲氧基苯基
A-844.	Cl	2,4-二甲氧基苯基
A-845.	Cl	3,4-二甲氧基苯基
A-846.	Cl	2,4-雙(三氟甲基)苯基
A-847.	Cl	3,5-雙(三氟甲基)苯基
A-848.	Cl	2-甲基-3-甲氧基苯基
A-849.	Cl	2-甲基-4-甲氧基苯基
A-850.	Cl	2-甲基-6-甲氧基苯基
A-851.	Cl	3-氯-4-氟苯基
A-852.	Cl	2-氯-4-氟苯基
A-853.	Cl	2-氯-6-氟苯基
A-854.	Cl	4-氯-2-氟苯基
A-855.	Cl	5-氯-2-氟苯基
A-856.	Cl	4-氟-3-甲基苯基
A-857.	Cl	2-氟-4-甲基苯基
A-858.	Cl	4-氟-2-甲基苯基
A-859.	Cl	2-氟-3-甲氧基苯基
A-860.	Cl	2-氟-4-甲氧基苯基
A-861.	Cl	2-氟-6-甲氧基苯基
A-862.	Cl	2-氟-4-三氟甲基苯基
A-863.	Cl	4-氯-3-甲基苯基
A-864.	Cl	2-氯-4-甲基苯基
A-865.	Cl	2-氯-6-甲基苯基
A-866.	Cl	5-氯-2-甲基苯基
A-867.	Cl	3-氯-2-甲基苯基
A-868.	Cl	2-氯-4-甲氧基苯基
A-869.	Cl	2-氯-6-甲氧基苯基
A-870.	Cl	2-氯-4-三氟甲基苯基
A-871.	Cl	3-氟-4-甲基苯基
A-872.	Cl	3-氟-4-異丙基苯基
A-873.	Cl	4-氟-3-甲基苯基
A-874.	Cl	3-氟-4-甲氧基苯基
A-875.	Cl	3-氟-4-乙氧基苯基
A-876.	Cl	3-氟-4-三氟甲基苯基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-877.	Cl	3-氯-4-甲基苯基
A-878.	Cl	3-氯-4-甲氧基苯基
A-879.	Cl	3-氯-4-乙氧基苯基
A-880.	Cl	3-氯-4-三氟甲基苯基
A-881.	Cl	3-甲基-4-甲氧基苯基
A-882.	Cl	4-氯-2,5-二氟苯基
A-883.	Cl	4-第三丁基-2-氟苯基
A-884.	Cl	2-氯-4-異丙基苯基
A-885.	Cl	4-乙氧基-2-氟苯基
A-886.	Cl	4-乙醯基-2-氟苯基
A-887.	Cl	2-噻吩基
A-888.	Cl	5-甲基噻吩-2-基
A-889.	Cl	4-甲基噻吩-2-基
A-890.	Cl	5-氯噻吩-2-基
A-891.	Cl	3-氯基噻吩-2-基
A-892.	Cl	5-甲醯基噻吩-2-基
A-893.	Cl	5-乙醯基噻吩-2-基
A-894.	Cl	5-(甲氧基亞胺基甲基)噻吩-2-基
A-895.	Cl	5-(1-(甲氧基亞胺基)乙基)噻吩-2-基
A-896.	Cl	4-溴噻吩-2-基
A-897.	Cl	3,5-二氯噻吩-2-基
A-898.	Cl	3-噻吩基
A-899.	Cl	2-甲基噻吩-3-基
A-900.	Cl	2,5-二氯噻吩-3-基
A-901.	Cl	2,4,5-三氯噻吩-3-基
A-902.	Cl	2-咪喃基
A-903.	Cl	5-甲基咪喃-2-基
A-904.	Cl	5-氯咪喃-2-基
A-905.	Cl	4-甲基咪喃-2-基
A-906.	Cl	3-氯基咪喃-2-基
A-907.	Cl	5-乙醯基咪喃-2-基
A-908.	Cl	3-咪喃基
A-909.	Cl	2-甲基咪喃-3-基
A-910.	Cl	2,5-二甲基咪喃-3-基
A-911.	Cl	2-吡啶基
A-912.	Cl	3-氯吡啶-2-基
A-913.	Cl	3-氯吡啶-2-基
A-914.	Cl	3-溴吡啶-2-基
A-915.	Cl	3-三氟甲基吡啶-2-基
A-916.	Cl	3-甲基吡啶-2-基
A-917.	Cl	3-乙基吡啶-2-基
A-918.	Cl	3,5-二氯吡啶-2-基
A-919.	Cl	3,5-二氯吡啶-2-基

序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-920.	Cl	3,5-二溴吡啶-2-基
A-921.	Cl	3,5-二甲基吡啶-2-基
A-922.	Cl	3-氟-5-三氟甲基吡啶-2-基
A-923.	Cl	3-氟-5-氟吡啶-2-基
A-924.	Cl	3-氟-5-甲基吡啶-2-基
A-925.	Cl	3-氟-5-氯吡啶-2-基
A-926.	Cl	3-氟-5-甲基吡啶-2-基
A-927.	Cl	3-甲基-5-氟吡啶-2-基
A-928.	Cl	3-甲基-5-氯吡啶-2-基
A-929.	Cl	5-硝基吡啶-2-基
A-930.	Cl	5-氟基吡啶-2-基
A-931.	Cl	5-甲氧羰基吡啶-2-基
A-932.	Cl	5-三氟甲基吡啶-2-基
A-933.	Cl	5-甲基吡啶-2-基
A-934.	Cl	4-甲基吡啶-2-基
A-935.	Cl	6-甲基吡啶-2-基
A-936.	Cl	3-吡啶基
A-937.	Cl	2-氯吡啶-3-基
A-938.	Cl	2-溴吡啶-3-基
A-939.	Cl	2-甲基吡啶-3-基
A-940.	Cl	2,4-二氯吡啶-3-基
A-941.	Cl	2,4-二溴吡啶-3-基
A-942.	Cl	2,4-二氟吡啶-3-基
A-943.	Cl	2-氟-4-氯吡啶-3-基
A-944.	Cl	2-氯-4-氟吡啶-3-基
A-945.	Cl	2-氯-4-甲基吡啶-3-基
A-946.	Cl	2-甲基-4-氟吡啶-3-基
A-947.	Cl	2-甲基-4-氯吡啶-3-基
A-948.	Cl	2,4-二甲基吡啶-3-基
A-949.	Cl	2,4,6-三氯吡啶-3-基
A-950.	Cl	2,4,6-三溴吡啶-3-基
A-951.	Cl	2,4,6-三甲基吡啶-3-基
A-952.	Cl	2,4-二氯-6-甲基吡啶-3-基
A-953.	Cl	4-吡啶基
A-954.	Cl	3-氯吡啶-4-基
A-955.	Cl	3-溴吡啶-4-基
A-956.	Cl	3-甲基吡啶-4-基
A-957.	Cl	3,5-二氯吡啶-4-基
A-958.	Cl	3,5-二溴吡啶-4-基
A-959.	Cl	3,5-二甲基吡啶-4-基
A-960.	Cl	4-嘧啶基
A-961.	Cl	5-氯嘧啶-4-基
A-962.	Cl	5-氟嘧啶-4-基

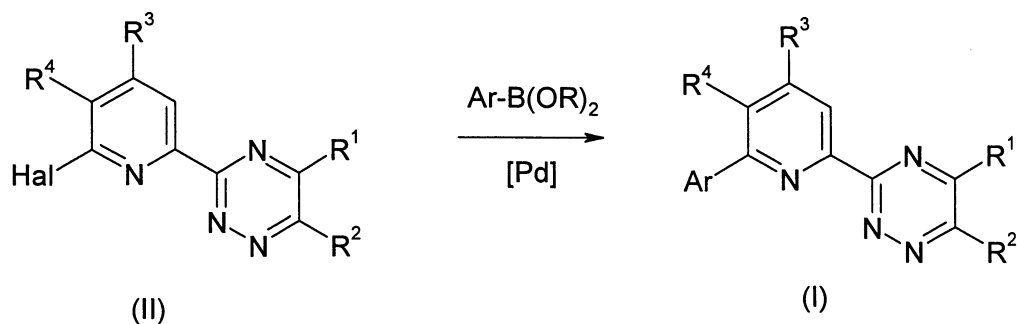
序號	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
A-963.	Cl	5-氟-6-氯嘧啶-4-基
A-964.	Cl	2-甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-965.	Cl	2,5-二甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-966.	Cl	5-甲基-6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-967.	Cl	6-三氟甲基嘧啶-4-基
A-968.	Cl	2-甲基-5-氟嘧啶-4-基
A-969.	Cl	2-甲基-5-氯嘧啶-4-基
A-970.	Cl	5-氯-6-甲基嘧啶-4-基
A-971.	Cl	5-氯-6-乙基嘧啶-4-基
A-972.	Cl	5-氯-6-異丙基嘧啶-4-基
A-973.	Cl	5-溴-6-甲基嘧啶-4-基
A-974.	Cl	5-氟-6-甲基嘧啶-4-基
A-975.	Cl	5-氟-6-氟甲基嘧啶-4-基
A-976.	Cl	2,6-二甲基-5-氯嘧啶-4-基
A-977.	Cl	5,6-二甲基嘧啶-4-基
A-978.	Cl	2,5-二甲基嘧啶-4-基
A-979.	Cl	2,5,6-三甲基嘧啶-4-基
A-980.	Cl	5-甲基-6-甲氧基嘧啶-4-基
A-981.	Cl	5-嘧啶基
A-982.	Cl	4-甲基嘧啶-5-基
A-983.	Cl	4,6-二甲基嘧啶-5-基
A-984.	Cl	2,4,6-三甲基嘧啶-5-基
A-985.	Cl	4-三氟甲基-6-甲基嘧啶-5-基
A-986.	Cl	2-嘧啶基
A-987.	Cl	4,6-二甲基嘧啶-2-基
A-988.	Cl	4,5,6-三甲基嘧啶-2-基
A-989.	Cl	4,6-二三氟甲基嘧啶-2-基
A-990.	Cl	4,6-二甲基-5-氯嘧啶-2-基

### 【實施方式】

通式 I 之本發明化合物可類似於最初引用之先前技術，使用有機合成之標準方法來製備。

例如，可根據流程 1 所示之方法製備式 I 化合物，其中 R<sup>5</sup> 為視情況經取代之苯基或雜芳基。

流程 1：



在流程1中， $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 及 $R^4$ 係如上文所定義。Ar為視情況經取代之苯基或視情況經取代之5或6員雜芳基。R為H或 $C_1$ - $C_4$ 烷基，或與其他分子 $\text{Ar-B(OR)}_2$ 一起形成苯基酮酸酐。Hal為氯、溴或碘。

根據流程1，使式II之2-(6-鹵基吡啶-2-基)三吡與通式 $\text{Ar-B(OR)}_2$ 之(雜)芳基酮酸衍生物在Suzuki偶合條件下，亦即在鈀催化劑存在下，在例如Acc. Chem. Res. 15，第178-184頁(1982)，Chem. Rev. 95，第2457-2483頁(1995)及其中引用文獻以及於J. Org. Chem. 68，第9412頁(2003)中所揭示之本身已知之反應條件下反應。詳言之，合適催化劑為肆(三苯基膦)鈀(0)、氯化雙(三苯基膦)鈀(II)、氯化雙(乙腈)鈀(II)、氯化[1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵]鈀(II)/二氯甲烷錯合物、雙[1,2-雙(二苯基膦)乙烷]鈀(0)及氯化[1,4-雙(二苯基膦)丁烷]鈀(II)。催化劑之量通常為以化合物II計0.1至10 mol%。化合物II與(雜)芳基酮酸衍生物之莫耳比通常在1:2至2:1之範圍內。

以類似於流程1之方式，例如在Stille偶合或Kumada偶合之意義上，式I化合物(其中 $R^5$ 為烷基、環烷基、視情況經取代之苄基或雜芳基甲基)可經由過濾金屬催化之偶合反應，藉由使化合物II與有機金屬化合物 $\text{Met-R}^5$ (其中 $R^5$ 係如

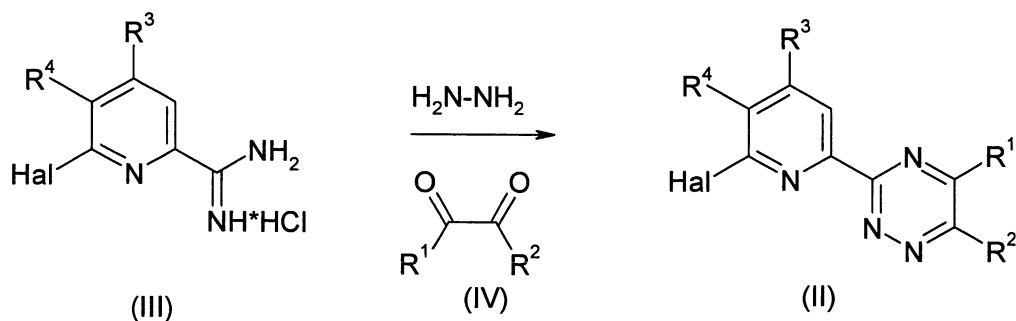
上文所定義且 Met 為基團  $MgX$ 、 $SnR_3$  或  $ZnX$  ( $X=$  氟、溴或碘， $R=$  烷基)) 反應來製備。

以類似於流程 1 之方式，在親核取代之意義上，式 I 化合物 (其中  $R^5$  為烷氧基、鹵烷氧基、環烷氧基、視情況經取代之苯氧基或雜芳氧基) 可藉由使化合物 II 與適當烷醇鹽  $OR^5$  (其中  $R^5$  係如上文所定義) 反應來製備。

就此而言，式 II 之 3-(6-鹵基吡啶-2-基) 三吡可藉由下列流程中所示之方法自相應式 III 之脒化合物來製備。

化合物 II (其中  $R^1$ 、 $R^2$  彼此獨立地為烷基、鹵烷基或與其所連接之碳原子一起形成根據以上定義之飽和碳環或雜環) 之製備可例如根據流程 2 中所示之合成來達成。

流程 2：



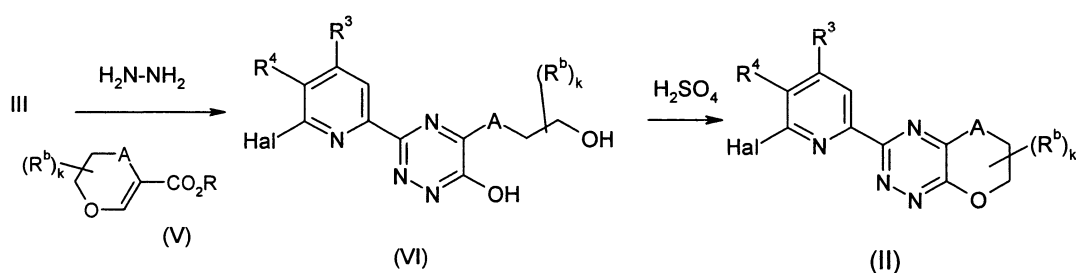
在流程 2 中，Hal、 $R^3$  及  $R^4$  係如上文所定義。 $R^1$  及  $R^2$  彼此獨立地為  $C_1$ - $C_8$  烷基、 $C_1$ - $C_8$  鹵烷基或與其所連接之碳原子一起形成飽和碳環或雜環，例如上述環 Q-1、Q-4 或 Q-8 中之一者。根據流程 2，式 III 之脒化合物與肼及化合物 IV 相繼或一鍋反應，得到式 II 化合物。一般而言，首先進行與肼 (通常採用氫氧化鉍之形式) 之反應。隨後添加化合物 IV。若適當，增加溫度以使反應完成。



式IV化合物為已知的且可藉由標準方法製備，例如根據EP 267 378；Tetrahedron Letters, 2003，第2307頁；Tetrahedron Letters, 1992，第8131頁；Tetrahedron Letters, 1987，第551頁；J. Molec. Catalysis 208 (1-2), 2004，第135-145頁。例如，3,4-二氧雜環戊烷可藉由於吡啶中使用N-溴代丁二醯亞胺及四氯化碳(參見Tetrahedron Letters, 44 (2003)第4909頁)或於二甲亞砜中使用鄰氧碘基苯甲酸(參見Tetrahedron Letters, 35 (1994) S. 8019)氧化3,4-雙羥基氧雜環戊烷來製備。脘化合物III同樣為已知的或可例如類似於US 2003/0087940 A1及Bioorg. Med. Chem. Lett. 1571-1574 (2003)中所述之方法來製備。

類似流程II之方式，式II化合物(其中 $R^1$ 及 $R^2$ 與其所連接之碳原子一起形成基團Q-2或Q-3)可藉由流程3及4中所示之合成途徑來製備。

流程3：



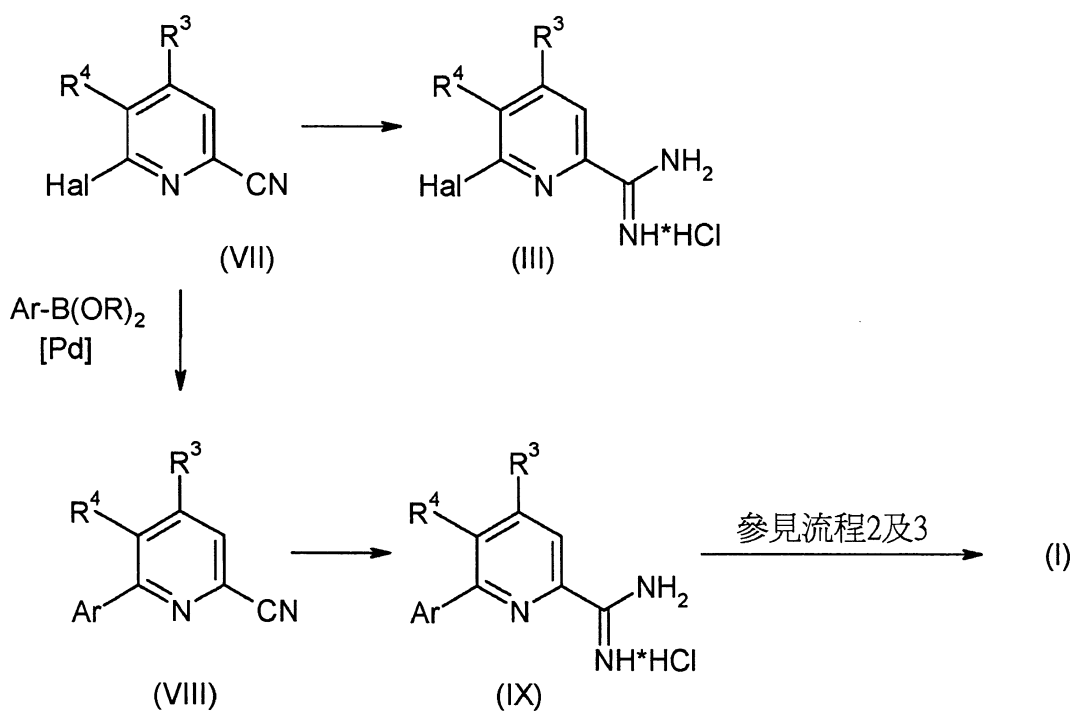
在流程3中，Hal、k、 $R^b$ 、 $R^3$ 及 $R^4$ 係如上文所定義。A為 $CH_2$ 或化學鍵。R為 $C_1$ - $C_4$ 烷基，詳言之為甲基或乙基。根據流程3，使脘化合物III與肼及式V之酯相繼反應。關於反應條件，以上關於流程2所述者類似地適用。接著使以此方式獲得之式VI之雙羥基化合物例如藉由硫酸處理而環

化脫水。式V之酯為已知的或可類似文獻已知方法來製備(參見J. Heterocycl. Chem., 32 (1995)第735頁及Liebig's Ann. Chem. 1974, 第468-476頁)。

就此而言, 通式III化合物可由通式VII之相應2-氰基吡啶化合物來製備(參見流程4)。為此目的, 使用US 4,873,248中所述之方法, 藉由以諸如甲醇鈉或乙醇鈉之鹼金屬醇鹽相繼處理, 且隨後與氯化銨反應而將2-氰基吡啶化合物VII轉化為化合物III。在流程1至3中所示之後續步驟中, 亦可能使用氫溴酸鹽、乙酸鹽、硫酸鹽或甲酸鹽代替氫氰酸鹽。式VII之氰基吡啶例如自US 2003/087940、WO 2004/026305、WO 01/057046及Bioorg. Med. Chem. Lett.第1571-1574頁(2003)已知, 或其可藉由已知製備方法來製備。

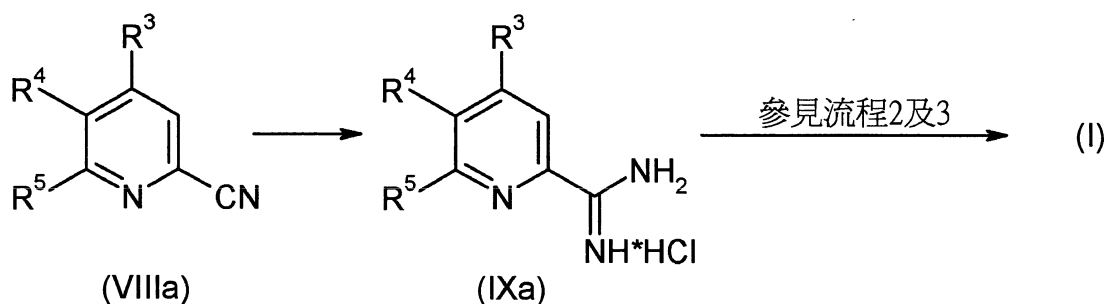
根據第二合成途徑(參見流程4), 本發明之化合物(其中 $R^5$ 為如流程1所定義之基團Ar)可由氰基吡啶VII來製備。為此目的, 如流程1所述, 最初使化合物VII與(雜)芳基酮酸化合物 $Ar-B(OR)_2$ 偶合, 且將所得6-(雜)芳基-2-氰基吡啶在關於化合物VII所述之反應條件下轉化為脘化合物IX。接著可將化合物IX在關於流程2及3所述之條件下轉化為相應三吡啶化合物。

流程4:



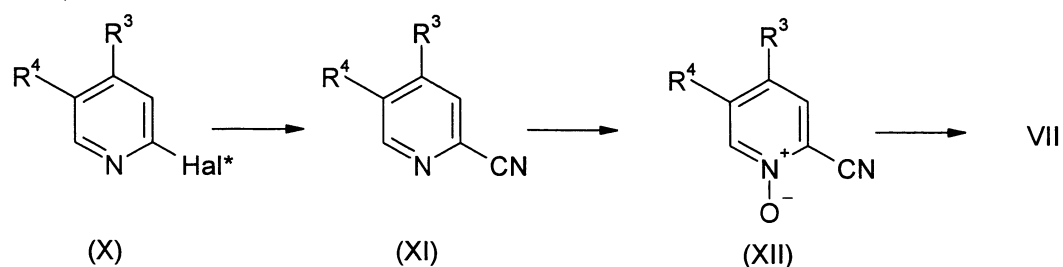
此外，式 VIIIa 化合物 (其中  $R^5$  具有上述含義中之一者，詳言之為不同於 Ar 之含義) 為已知的。使用類似於流程 2 至 4 之方法，可將化合物 VIIIa 轉化為本發明之相應化合物 I。

流程 4a：



詳言之，通式 VII 之化合物 (若其為未知) 可藉由流程 5 中所示之方法來製備。

流程 5：



在流程5中， $R^3$ 及 $R^4$ 係如上文所定義。Hal\*為氯、溴或碘。

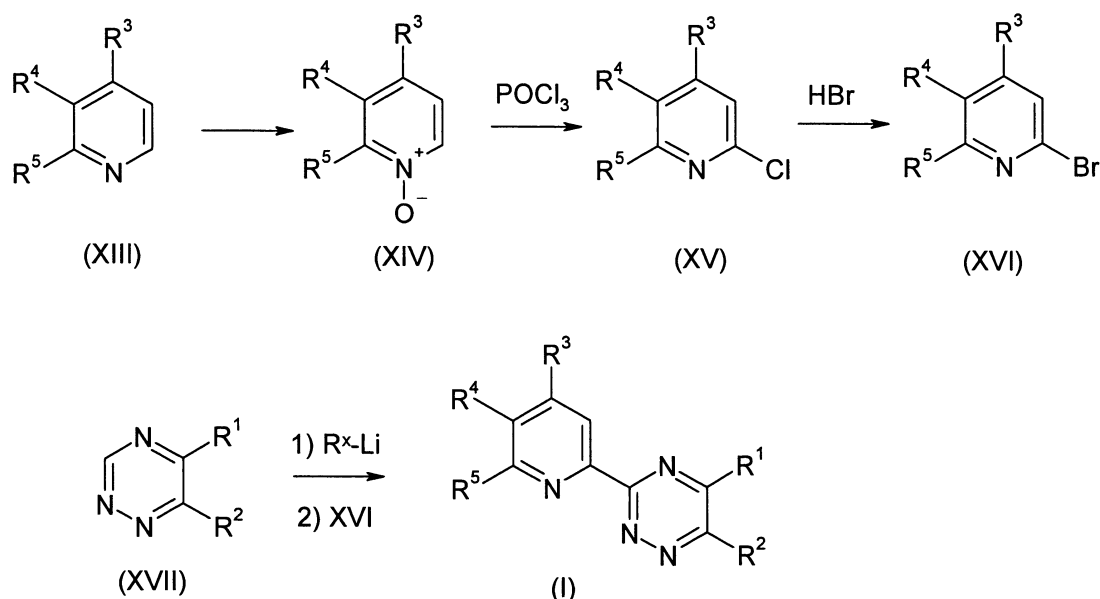
使用有機化學之標準方法，藉由使X與氰化物離子，例如與氰化鈉或氰化鉀(參見EP-A 97460，製備實例1)、氰化銅(I)(參見EP-A 34917，製備實例3)或氰化三甲基矽烷反應來進行將2-鹵基吡啶X轉化為2-氰基吡啶XI。接著使用本身已知之方法，藉由以過酸處理將以此方式獲得之化合物XI轉化為吡啶氮氧化物XII。可類似於已知方法進行將XI轉化為XII，例如藉由以有機酸(諸如甲酸、乙酸、氯乙酸或三氟乙酸)中之過氧化氫處理XI(參見例如J. Org. Chem. 55，第738-741頁(1990)及Organic Synthesis, Collect.第IV卷，第655-656頁(1963))或藉由使XI與有機過酸(諸如間氯過苯甲酸)在惰性溶劑(例如鹵化烴，諸如二氯甲烷或二氯乙烷)中反應(參見例如Synthetic Commun. 22(18)，第2645頁，(1992); J. Med. Chem. 2146 (1998))。亦可類似於K. B. Sharpless(J. Org. Chem. 63(5)，第7740頁(1998))所述之方法，藉由在催化量(例如5重量%)之銻(VII)化合物(諸如甲基三氧化銻( $H_3CReO_3$ ))存在下，使XI與過氧化氫在鹵化烴(諸如二氯甲烷或二氯乙烷)中反應來進行將XI轉化為XII。

接著使XII與鹵化劑(諸如 $POCl_3$ 或 $POBr_3$ )反應，產生相應化合物VII。對於得到VII之XII之反應而言，一般採用以反應之化學計量計過量之鹵化劑。反應可於惰性有機溶劑中進行，且經常在不存在溶劑時進行，而鹵化劑則一般充當溶劑。反應溫度通常在 $20^\circ C$ 至鹵化劑沸點之範圍內。若

適當，有利的是最初使用諸如  $\text{POCl}_3$  之氯化劑將氯原子引入吡啶氮氧化物之2位，且接著例如藉由以  $\text{HBr}$  或碘化劑處理來進行鹵素交換，得到式 VII 化合物 (其中  $\text{Hal}=\text{Br}$  或  $\text{I}$ )。

另外，本發明之化合物 I 可根據流程 6 中所示之合成來製備：

流程 6：



在流程 6 中， $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$  及  $\text{R}^5$  係如上文所定義。 $\text{R}^x$  例如為  $\text{C}_1\text{-C}_6$  烷基，尤其為正丁基或苯基。

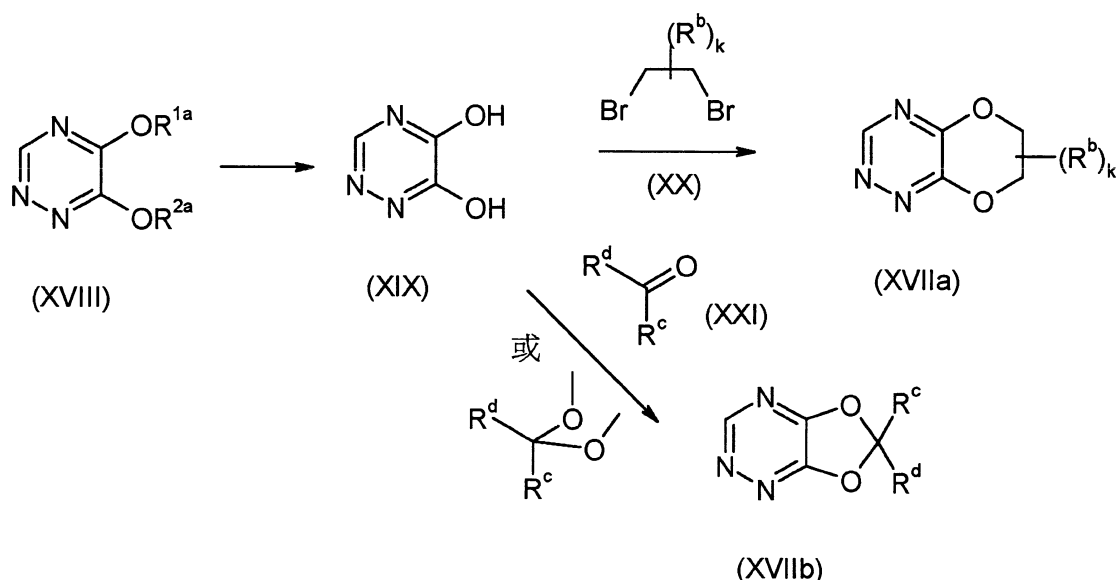
根據流程 6，在第一步驟中，根據有機化學之標準方法將吡啶化合物 XIII 轉化為相應氮氧化物 XIV。流程 5 提及之將化合物 XI 轉化為化合物 XII 之方法可相應地適用。接著藉由與諸如  $\text{POCl}_3$  之氯化劑反應，將氮氧化物 XIV 轉化為相應 2-氯吡啶 XV。流程 5 中所示將化合物 XII 轉化為化合物 VII 之方法可相應地適用。隨後例如藉由類似於 US 5,271,217 及 Can. J. Chem. 75 (2) (1997) 第 169 頁中提及之方法以  $\text{HBr}$  處理氯吡啶 XV，根據有機化學之標準方法進行

氯-溴交換。

接著使以此方式獲得之溴吡啶與三吡啶化合物 XVII 偶合。為此目的，藉由以鋰鹼，詳言之為 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基鋰化合物(諸如正丁基鋰或苯基鋰)處理而將式 XVII 之三吡啶化合物轉化為相應鋰三吡啶化合物，接著使其與溴吡啶化合物 XVI 反應。可類似於 Tetrahedron Lett. 41(10) (2000) 第 1653 頁中所述之方法進行 XVI 與鋰化合物 XVII 之反應。

三吡啶化合物 XVII 為已知的或可類似於製備三吡啶化合物之已知方法來製備。三吡啶化合物 XVII (其中 R<sup>1</sup> 及 R<sup>2</sup> 為經由氧連接之基團) 可由 5,6-二烷氧基-1,2,4-三吡啶(諸如 5,6-二甲氧基-1,2,4-三吡啶)製備(參見 Chem. Ber. 109 (1976), 第 1113 頁)。

流程 7：



在流程 7 中，R<sup>b</sup> 及 k 係如上文所定義。R<sup>1a</sup> 及 R<sup>1b</sup> 為 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 烷基，詳言之為甲基。R<sup>c</sup> 及 R<sup>d</sup> 彼此獨立地為氫或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷

基。可類似於Chem. Ber. 109 (1976)，第1113頁中所述之方法進行將XVIII轉化為5,6-雙羥基-1,2,4-三吡。接著可使以此方式所獲得之雙羥基三吡XIX較佳在鹼(諸如鹼金屬氫氧化物或鹼金屬醇鹽)存在下，以類似於Heterocycl. Chem. 27 (1990)第151頁中所述之方法與1,2-二溴烷XX反應，得到縮合三吡XVIIa。此外，以類似於Chem. Berichte 124(3) (1991)第481頁，J. Chem. Soc., Perkin Trans 1, 1998，第3561頁；Synthesis (1986)，第122頁中所述之方法，雙羥基三吡XIX可與酮或醛XXI反應，得到縮合三吡XVIIb。

以常用方式，例如藉由與水混合物，分離各相且若適當層析純化粗產物來處理以流程1至7中所示之方法所獲得之反應混合物。獲得在減壓下及適度高溫下自揮發性組份純化或釋放之無色或淺棕色黏性油形式之一些中間物及最終產物。若獲得呈固體狀之中間物及最終產物，則亦可藉由再結晶或分解來進行純化。

若個別化合物I不可藉由上述途徑獲得，則其可藉由其他化合物I之衍生作用來製備。

若合成產生異構體混合物，然而一般不必需要分離，因為在某些情況下個別異構體可於使用處理期間或於應用期間(例如在光、酸或鹼作用下)相互轉化。例如，在處理植物之情況下，在使用後亦可於經處理之植物或待控制之有害真菌中發生此等轉化。

式I化合物適用作殺真菌劑。其特徵在於對抗來自子囊菌 (*Ascomycetes*)、半知菌 (*Deuteromycetes*)、卵菌

(*Oomycetes*)及擔子菌(*Basidiomycetes*)種類，尤其為對抗來自卵菌種類之廣泛範圍植物病原性真菌的優良活性。其中某些為全身活性的且可於農作物保護中用作葉之殺真菌劑、用作拌種之殺真菌劑及用作土壤殺真菌劑。

其對於控制各種農作物(諸如小麥、黑麥、大麥、燕麥、水稻、玉米、草、香蕉、棉花、大豆、咖啡、甘蔗、葡萄藤、水果及裝飾性植物及蔬菜植物，諸如黃瓜、菜豆、番茄、馬鈴薯及葫蘆)以及該等植物種子上之大量真菌而言尤其重要。

其尤其適用於控制以下植物疾病：

- 蔬菜、菜籽、甜菜、水果、水稻、大豆以及馬鈴薯上之鏈格孢菌(*Alternaria*)種(例如底腐病菌(*A. solani*)及赤星病菌(*A. alternata*))，及番茄上之鏈格孢菌種(例如底腐病菌(*A. solani*)或赤星病菌(*A. alternata*))，及小麥上之鏈格孢菌屬(*Alternaria ssp.*)(黑黴病)；
- 甜菜及蔬菜之根腐病菌(*Aphanomyces*)種；
- 穀物及蔬菜上之豌豆斑莢病菌(*Ascochyta*)種，例如小麥上之殼二孢屬殼針孢(*Ascochyta tritici*)(葉斑病)；
- 玉米、穀物、水稻及草地上之平臍蠕孢(*Bipolaris*)及內臍蠕孢(*Drechslera*)種(例如玉米上之玉蜀黍內臍蠕孢菌(*D. maydis*)、大麥上之網斑內臍蠕孢菌(*D. teres*)、小麥上之德氏黴菌(*D. tritici-repentis*))；
- 穀物(例如小麥或大麥)上之禾本科布氏白粉菌(*Blumeria graminis*)(白粉病(powdery mildew))；



- 草黴、蔬菜、花卉、小麥及葡萄藤上之灰黴孢菌 (*Botrytis cinerea*)(灰黴病(gray mold))；
- 萵苣上之萵苣霜黴病 (*Bremia lactucae*)；
- 玉米、大豆、水稻及甜菜上之葉斑病 (*Cercospora*)種，且例如大豆上之灰斑病菌 (*Cercospora sojina*)(葉斑)或紫斑病菌 (*Cercospora kikuchii*)(葉斑)；
- 小麥上之草本芽枝黴菌 (*Cladosporium herbarum*)(黑黴病)；
- 玉米、穀物、水稻上之旋孢腔菌 (*Cochliobolus species*)種(例如穀物上之禾旋孢腔菌 (*Cochliobolus sativus*)、水稻上之水稻旋孢腔菌 (*Cochliobolus miyabeanus*))；
- 大豆、棉花及其他植物上之炭疽菌 (*Colletotricum*)種(例如各種植物上之尖孢炭疽菌 (*C. acutatum*))及例如大豆上之平頭刺盤孢菌 (*Colletotricum truncatum*)(炭疽病 (antracnosis))；
- 大豆上之棒孢黴菌 (*Corynespora cassiicola*)(葉斑)；
- 大豆上之白紋羽束絲菌 (*Dematophora necatrix*)(根/莖腐爛)；
- 大豆上之莖潰瘍病菌 (*Diaporthe phaseolorum*)(莖腐爛)；
- 玉米、穀物、水稻及草地、大麥上之內臍蠕孢種、核腔菌 (*Pyrenophora*)種(例如網斑內臍蠕孢菌)，或小麥上之內臍蠕孢種、核腔菌種(例如德氏黴菌)；
- 葡萄藤上之艾司卡病 (*Esca*)，其源於厚垣暗枝頂孢菌

- (*Phaeoacremonium chlamydosporium*)、*Ph. Aleophilum*及層臥孔菌 (*Formitipora punctata*)(同義：松白腐菌 (*Phellinus punctatus*))；
- 葡萄藤上之黑痘病 (*Elsinoe ampelina*)；
  - 小麥之黑腐球菌屬 (*Epicoccum spp.*)(黑黴病)；
  - 玉米上之突臍蠕孢 (*Exserohilum*)種；
  - 葫蘆上之煙草白粉病 (*Erysiphe cichoracearum*)及蒼耳單絲殼 (*Sphaerotheca fuliginea*)；
  - 各種植物上之鐮孢菌 (*Fusarium*)及輪枝孢菌 (*Verticillium*)種(例如黃萎病菌 (*V. dahliae*))：例如穀物(例如小麥或大麥)上之禾穀鐮刀菌 (*F. graminearum*)或大刀鐮孢 (*F. culmorum*)(根腐爛)，或例如番茄上之尖孢鐮刀菌 (*F. oxysporum*)，或大豆上之茄病鐮刀菌 (*F. solani*)(莖腐爛)；
  - 穀物(例如小麥或大麥)上之禾頂囊殼菌 (*Gaeumanomyces graminis*)；
  - 穀物及水稻上之赤黴菌 (*Gibberella*)種(例如水稻上之藤倉赤毒菌 (*Gibberella fujikuroi*))；
  - 水稻上之穀物染色錯合物；
  - 葡萄藤上之葡萄球座菌 (*Guignardia budwelli*)；
  - 玉米及水稻上之長蠕孢菌 (*Helminthosporium*)種(例如禾生根瘤線蟲 (*H. graminicola*))；
  - 葡萄藤上之葡萄褐斑病菌 (*Isariopsis clavispora*)；
  - 大豆上之菜豆殼球孢菌 (*Macrophomina phasolina*)(根/莖

- 腐爛)；
- 穀物(例如小麥或大麥)上之雪黴葉枯病菌(*Microdochium nivale*)；
  - 大豆上之叉絲殼屬菌(*Microsphaera diffusa*)(白粉病)；
  - 穀物、香蕉及花生上之球腔菌(*Mycosphaerella*)種(小麥上之禾穀根結線蟲(*M. graminicola*)、香蕉上之斐濟球腔菌(*M. fijiesis*))；
  - 甘藍上之霜黴屬(*Peronospora*)種(例如芸苔根腫菌(*P. brassicae*))、球根植物上之霜黴屬種(例如洋蔥露菌病(*P. destructor*)及例如大豆上之霜黴病(*P. manshurica*)(葡萄霜黴病(downy mildew))；
  - 大豆上之豆薯層鏽菌(*Phakopsara pachyrhizi*)及邁博姆層鏽菌(*Phakopsara meibomia*)；
  - 大豆上之褐莖腐病菌(*Phialophora gregata*)(莖腐爛)；
  - 大豆、向日葵及葡萄藤上之擬莖點黴菌(*Phomopsis*)屬種(葡萄藤上之葡萄生單軸黴菌(*P. viticola*)，向日葵上之向日葵擬莖點黴(*P. helianthii*)；
  - 各種植物上之晚疫病菌(*Phytophthora*)種，例如胡椒上之辣椒疫黴菌(*P. capsici*)、大豆上之疫黴根腐菌(*Phytophthora megasperma*)(葉枯萎/莖腐爛)、番茄及馬鈴薯上之晚疫病菌(*Phytophthora infestans*)；
  - 葡萄藤上之葡萄生單軸黴菌(*Plasmopara viticola*)；
  - 蘋果上之白叉絲單囊殼菌(*Podospaera leucotricha*)；
  - 穀物上之卷毛狀假小尾孢(*Pseudocercospora*)

*herpotrichoides*) ;

- 蛇麻草及葫蘆上之假霜黴(*Pseudoperonospora*)種(例如黃瓜上之黃瓜霜黴菌(*P. cubensis*)或蛇麻草上之葎草假霜黴菌(*P. humili*)) ;
- 葡萄藤上之葡萄角斑葉焦病菌(*Pseudopezicula tracheiphilae*) ;
- 各種植物上之柄鏽菌(*Puccinia*)種，例如穀物(例如小麥或大麥)上之小麥葉鏽菌(*P. triticina*)、小麥條鏽菌(*P. striiformis*)、大麥柄鏽菌(*P. hordei*)或小麥柄鏽菌(*P. graminis*)，或蘆筍上之柄鏽菌種(例如蘆筍柄鏽菌(*P. asparagi*)) ;
- 穀物上之核腔菌(*Pyrenophora*)種 ;
- 水稻上之稻梨孢(*Pyricularia oryzae*)、紋枯病菌(*Corticium sasakii*)、帚梗柱孢(*Sarocladium oryzae*)、帚枝黴屬真菌(*S.attenuatum*)、稻葉黑粉菌(*Entyloma oryzae*) ;
- 草地及穀物上之水稻瘟病菌(*Pyricularia grisea*) ;
- 草地、水稻、玉米、棉花、菜籽、向日葵、甜菜、蔬菜及其他植物上之腐黴菌屬(*Pythium spp.*)(例如棉腐病(*P. ultimum*)或瓜果腐黴菌(*P. aphanidermatum*)) ;
- 大麥上之柱隔孢菌(*Ramularia collo-cygni*)(柱隔孢屬(*Ramularia*)/生理學葉斑) ;
- 棉花、水稻、馬鈴薯、草地、玉米、菜籽、甜菜、蔬菜及其他植物上之絲核菌(*Rhizoctonia*)種(例如立枯絲核菌

(*R. solani*)，或例如大豆上之立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*)(根/莖腐爛)或小麥或大麥上之麥紋枯病菌(*Rhizoctonia cerealis*)(重眼斑病)；

- 大麥(葉斑)、黑麥及黑小麥上之黑麥喙孢(*Rhynchosporium secalis*)；
- 菜籽、向日葵及其他植物上之核盤菌(*Sclerotinia*)種，例如大豆上之油菜菌核病(*S. sclerotiorum*)(莖腐爛)或齊整小菌核菌病(*Sclerotinia rolfsii*)(莖腐爛)；
- 大豆上之褐紋病(*Septoria glycines*)(葉斑)；
- 小麥上之小麥殼針孢(*Septoria tritici*)及穎枯殼多孢(*Stagonospora nodorum*)；
- 葡萄藤上之白粉病(*Erysiphe*)(同義鉤絲殼屬線蟲屬(*Uncinula necator*))；
- 玉米及草地之*Setospaeria*種；
- 玉米上之絲軸黑粉菌(*Sphacelotheca reilinia*)；
- 小麥上之穎枯殼多孢(葉斑)；
- 大豆及棉花上之根串珠黴(*Thievaliopsis*)種；
- 穀物上之腥黑粉菌(*Tilletia*)種；
- 小麥及大麥上之肉核核湖菌(*Typhula incarnata*)(雪黴病)；
- 穀物、玉米及甜菜上之黑粉菌(*Ustilago*)種；及
- 蘋果及梨上之黑星菌(*Venturia*)種(瘡痂病(scab))(例如蘋果上之蘋果黑星菌(*V. inaequalis*))。

另外，式I化合物適用於在材料(例如木材、紙張、油漆

分散液、纖維或織物)保護及儲存產品保護中控制有害真菌。在木材保護中，尤其注意下列有害真菌：

子囊菌，諸如萎凋病菌屬(*Ophiostoma* spp.)、長喙殼菌屬(*Ceratocystis* spp.)、出芽短梗黴菌(*Aureobasidium pullulans*)、帚枝黴屬(*Sclerophoma* spp.)、毛殼菌屬(*Chaetomium* spp.)、腐殖黴屬(*Humicola* spp.)、彼得殼屬(*Petriella* spp.)、針葉莧屬(*Trichurus* spp.)；擔子菌，諸如粉孢革菌屬(*Coniophora* spp.)、革蓋菌屬(*Coriolus* spp.)、革襴菌屬(*Gloeophyllum* spp.)、香菇菌屬(*Lentinus* spp.)、側耳菌屬(*Pleurotus* spp.)、茯苓菌屬(*Poria* spp.)、龍介蟲屬(*Serpula* spp.)及乾酪菌屬(*Tyromyces* spp.)；半知菌，諸如麴黴屬(*Aspergillus* spp.)、枝孢菌屬(*Cladosporium* spp.)、青黴菌屬(*Penicillium* spp.)、木黴菌屬(*Trichoderma* spp.)、鏈格孢菌屬、擬青黴菌屬(*Paecilomyces* spp.)及接合菌(Zygomycetes)，諸如毛黴屬(*Mucor* spp.)；此外，在材料保護中注意下列酵母：念珠菌屬(*Candida* spp.)及釀酒酵母(*Saccharomyces cerevisiae*)。

式I化合物係藉由以殺真菌有效量之活性化合物處理真菌或待保護以免於真菌侵襲之植物、種子、材料或土壤而採用。該應用可於材料、植物或種子受真菌感染之前及之後進行。

殺真菌組合物一般包含0.1與95重量%之間，較佳0.5與90重量%之間之活性化合物。

當用於植物保護時，施用量視所需效應種類而定為每公

頃0.01與2.0公斤之間活性化合物。

在種子處理中，每100公斤種子一般必需之活性化合物量為1至1000公克，較佳為每100公斤種子5至100公克。

當用於材料或儲存產品保護時，活性化合物之施用量視施用區域類型及所需效應而定。材料保護中慣用之量例如為每立方公尺經處理材料0.001公克至2公斤，較佳0.005公克至1公斤活性化合物。

式I化合物可呈生物活性不同之不同晶體變型存在。其亦形成本發明標的之部分。

可將式I化合物轉化為慣用調配物，例如溶液、乳液、懸浮液、粉塵、粉末、漿料及顆粒。使用形式視特定預期目的而定；在每種情況下均應確保根據本發明化合物之精細及均勻分佈。

該等調配物以已知方式來製備，例如藉由以溶劑及/或載劑(若需要，則使用乳化劑及分散劑)來補充活性化合物。適合此目的之溶劑/助劑基本上為：

- 水、芳族溶劑(例如，Solvesso產品，二甲苯)、石蠟(例如，礦物油餾份)、醇類(例如，甲醇、丁醇、戊醇、苜醇)、酮類(例如，環己酮、 $\gamma$ -丁內酯)、吡咯啉酮類(NMP、NOP)、乙酸酯類(二乙酸乙二醇酯)、二醇類、脂肪酸二甲醯胺類、脂肪酸類及脂肪酸酯類。原則上亦可使用溶劑混合物；

- 載劑，諸如經研磨之天然礦物質(例如，高嶺土(kaolin)、黏土、滑石、白堊)及經研磨之合成礦物質(例

如，經高度分散之二氧化矽、矽酸鹽)；乳化劑，諸如非離子型及陰離子型乳化劑(例如，聚氧伸乙基脂肪醇醚、烷基磺酸鹽及芳基磺酸鹽)及分散劑，諸如木質素亞硫酸鹽廢液及甲基纖維素。

所用合適界面活化劑為木質素磺酸、萘磺酸、苯酚磺酸、二丁基萘磺酸之鹼金屬鹽、鹼土金屬鹽及銨鹽、烷基芳基磺酸鹽、烷基硫酸鹽、烷基磺酸鹽、脂肪醇硫酸鹽、脂肪酸及硫酸化脂肪醇二醇醚，此外為磺酸化萘及萘衍生物與甲醛之縮合物、萘或萘磺酸與苯酚及甲醛之縮合物、聚氧伸乙基辛基苯基醚、乙氧基化異辛基苯酚、辛基苯酚、壬基苯酚、烷基苯基聚乙二醇醚、三丁基苯基聚乙二醇醚、三硬脂醯基苯基聚乙二醇醚、烷基芳基聚醚醇、醇及脂肪醇/環氧乙烷縮合物、乙氧基化蓖麻油、聚氧伸乙基烷基醚、乙氧基化聚氧化丙烯、月桂醇聚乙二醇醚縮醛、山梨糖醇酯、木質素亞硫酸鹽廢液及甲基纖維素。

適用於製備直接可噴灑之溶液、乳液、漿料或油分散液之物質為具有中至高沸點之礦物油餾份，諸如煤油或柴油，此外為煤焦油及源於植物或動物之油，脂族烴、環烴及芳族烴，例如甲苯、二甲苯、石蠟、四氫萘、烷基化萘或其衍生物、甲醇、乙醇、丙醇、丁醇、環己醇、環己酮、異佛爾酮，強極性溶劑，例如二甲亞砷、N-甲基吡咯啉酮及水。

可藉由將活性物質與固體載劑混合或共同研磨來製備粉末、供噴灑之材料及可粉塵化之產品。



可藉由將活性化合物結合至固體載劑來製備顆粒，例如經塗覆之顆粒、經浸漬之顆粒及均質顆粒。固體載劑之實例為：礦物土，諸如二氧化矽凝膠、矽酸鹽、滑石、高嶺土、美國活性白土、石灰石、石灰、白堊、紅玄武土、黃土、黏土、白雲石、矽藻土、硫酸鈣、硫酸鎂、氧化鎂；經研磨之合成材料；肥料，諸如硫酸銨、磷酸銨、硝酸銨、尿素；及源於植物之產品，諸如穀粉、樹皮粉、木粉及堅果殼粉；纖維素粉末及其他固體載劑。

一般而言，調配物包含0.01至95重量%，較佳0.1至90重量%之活性化合物。所用活性化合物之純度為90%至100%，較佳為95%至100%(根據NMR光譜)。

以下為調配物之實例：

#### 1. 供以水稀釋之產品

##### A. 水溶性濃縮物(SL, LS)

將10重量份活性化合物溶解於90重量份水或水溶性溶劑中。或者，添加濕潤劑或其他助劑。活性化合物經水稀釋即溶解。以此方式，獲得具有10重量%活性化合物含量之調配物。

##### B. 分散性濃縮物(DC)

藉由添加10重量份分散劑(例如聚乙烯吡咯啉酮)，將20重量份活性化合物溶解於70重量份環己酮中。經水稀釋產生分散液。活性化合物含量為20重量%。

##### C. 可乳化濃縮物(EC)

藉由添加十二烷基苯磺酸鈣及蓖麻油乙氧化物(每一情

況下均為5重量份)，將15重量份活性化合物溶解於75重量份二甲苯中。經水稀釋產生乳液。該調配物具有15重量%之活性化合物含量。

#### D. 乳液(EW、EO、ES)

藉由添加十二烷基苯磺酸鈣及蓖麻油乙氧化物(每一情況下均為5重量份)，將25重量份活性化合物溶解於35重量份二甲苯中。藉助於乳化機(例如Ultraturrax)將此混合物引入30重量份水中，且使其成為均質乳液。經水稀釋產生乳液。該調配物具有25重量%之活性化合物含量。

#### E. 懸浮液(SC、OD、FS)

在一攪拌型球磨機中，藉由添加10重量份分散劑及濕潤劑及70重量份水或有機溶劑，粉碎20重量份活性化合物以產生精細活性化合物懸浮液。經水稀釋產生活性化合物之穩定懸浮液。該調配物中之活性化合物含量為20重量%。

#### F. 水分散性顆粒及水溶性顆粒(WG, SG)

藉由添加50重量份分散劑及濕潤劑，將50重量份活性化合物精細研磨，且藉助於技術設備(例如擠壓機、噴淋塔、流化床)將其製備為水分散性或水溶性顆粒。經水稀釋產生活性化合物之穩定分散液或溶液。該調配物具有50重量%之活性化合物含量。

#### G. 水分散性粉末及水溶性粉末(WP、SP、SS、WS)

藉由添加25重量份分散劑、濕潤劑及矽膠，在轉子-定子研磨機中研磨75重量份活性化合物。經水稀釋產生活性化合物之穩定分散液或溶液。該調配物之活性化合物含量

為75重量%。

#### H.凝膠調配物

將20重量份活性化合物、10重量份分散劑、1重量份膠凝劑及70重量份水或有機溶劑於一球磨機中研磨以產生精細懸浮液。經水稀釋獲得具有20重量%之活性化合物含量之穩定懸浮液。

#### 2.未經稀釋之待施用產品

##### I.可粉塵化粉末(DP, DS)

將5重量份活性化合物精細研磨，且與95重量份經精細分開之高嶺土充分混合。此產生具有5重量%之活性化合物含量之可粉塵化產品。

##### J.顆粒(GR、FG、GG、MG)

將0.5重量份活性化合物精細研磨且與99.5重量份載體結合。當前方法為擠壓、噴霧乾燥或流化床。此產生具有0.5重量%之活性化合物含量之未經稀釋之待施用顆粒。

##### K.ULV溶液(UL)

將10重量份活性化合物溶解於90重量份有機溶劑(例如二甲苯)中。此產生具有10重量%之活性化合物含量之未經稀釋之待施用產品。

對於種子處理而言，通常使用水溶性濃縮物(LS)、懸浮液(FS)、可粉塵化粉末(DS)、水分散性及水溶性粉末(WS、SS)、乳液(ES)、可乳化濃縮物(EC)及凝膠調配物(GF)。該等調配物可以未經稀釋形式或較佳經稀釋形式施用於種子。施用可在播種之前進行。

活性化合物可藉助於噴灑、霧化、粉塵化、散佈或澆注而以原樣、以其調配物形式或自其製備之使用形式來使用，例如以可直接噴灑之溶液、粉末、懸浮液或分散液、乳液、油狀分散液、漿料、可粉塵化之產品、散佈材料或顆粒之形式。使用形式完全視預期目的而定；其目的在於確保在各種情況下本發明活性化合物之盡可能最精細分佈。

水性使用形式可藉由添加水而自乳液濃縮物、漿料或可濕性粉末(可濕性粉末、油狀分散液)來製備。為製備乳液、漿料或油狀分散液，原樣或溶解於油或溶劑中之物質可藉助於濕潤劑、增黏劑、分散劑或乳化劑而於水中均質化。然而，亦可能製備由活性物質、濕潤劑、增黏劑、分散劑或乳化劑及(若適當)溶劑或油組成之濃縮物，且該等濃縮物適合以水來稀釋。

即用型製劑中之活性化合物濃度可在相對廣泛之範圍內變化。一般而言，其在0.0001與10%之間，較佳在0.01與1%之間。

該等活性化合物亦可成功用於超低容量法(ULV)，藉此可能施用具有95重量%以上活性化合物之調配物，或甚至施用無添加劑之活性化合物。

可將各種類型之油、濕潤劑、佐劑、除草劑、殺真菌劑、其他殺蟲劑或殺菌劑添加至活性化合物，甚至(若適當)直至立即使用之前(槽式混合)。該等試劑可與本發明之組合物以1:100至100:1，較佳為1:10至10:1之重量比混

雜。

在此意義上，合適佐劑尤其為：經有機改質之聚矽氧烷，例如 Break Thru S 240<sup>®</sup>；醇烷氧化物，例如 Atplus 245<sup>®</sup>、Atplus MBA 1303<sup>®</sup>、Plurafac LF 300<sup>®</sup>及 Lutensol ON 30<sup>®</sup>；EO/PO嵌段聚合物，例如 Pluronic<sup>®</sup> RPE 2035<sup>®</sup>及 Genapol<sup>®</sup> B；醇乙氧化物，例如 Lutensol XP 80<sup>®</sup>；及二辛基磺基琥珀酸鈉，例如 Leophen<sup>®</sup> RA。

本發明之組合物亦可以殺真菌劑之使用形式與其他活性化合物(例如除草劑、殺害蟲劑、生長調節劑、殺真菌劑)或亦可與肥料一起存在。藉由將殺真菌劑之使用形式之化合物I或包含其之組合物與其他殺真菌劑混合，在許多情況下達成殺真菌活性範圍之擴增。

下列可與本發明之化合物聯合使用之殺真菌劑清單意欲說明可能之組合而不為其限制：

嗜毬果傘素(strobilurins)

亞托敏(azoxystrobin)、醚菌胺(dimoxystrobin)、烯肱菌酯(enestroburin)、氟氧菌胺(fluxastrobin)、克收欣(kresoxim-methyl)、甲氧亞胺菌酯(methominostrobin)、啞氧菌酯(picoxystrobin)、百克敏(pyraclostrobin)、三氟敏(trifloxystrobin)、奧瑞菌胺(orysastrobin)、(2-氯-5-[1-(3-甲基苄氧基亞胺基)乙基]苄基)胺基甲酸甲酯、(2-氯-5-[1-(6-甲基吡啶-2-基甲氧基亞胺基)乙基]苄基)胺基甲酸甲酯及2-(鄰-(2,5-二甲基苄氧基亞甲基)苄基)-3-甲氧基丙烯酸甲酯；

## 羧醯胺類

- 羧醯苯胺類：苯霜靈 (benalaxyl)、麥鏽靈 (benodanil)、博克利 (boscalid)、萎鏽靈 (carboxin)、滅鏽胺 (mepronil)、甲呋醯胺 (fenfuram)、環醯菌胺 (fenhexamid)、氟多寧 (flutolanil)、福拉比 (furametpyr)、滅達樂 (metalaxyl)、呋醯胺 (ofurace)、毆殺斯 (oxadixyl)、氧化萎鏽靈 (oxycarboxin)、吡噻菌胺 (penthioopyrad)、噻氟菌胺 (thifluzamide)、汰敵寧 (tiadinil)、N-(4'-溴聯苯-2-基)-4-二氟甲基-2-甲基噻唑-5-甲醯胺、N-(4'-三氟甲基聯苯-2-基)-4-二氟甲基-2-甲基噻唑-5-甲醯胺、N-(4'-氯-3'-氟聯苯-2-基)-4-二氟甲基-2-甲基噻唑-5-甲醯胺、N-(3',4'-二氯-4-氟聯苯-2-基)-3-二氟甲基-1-甲基吡唑-4-甲醯胺、N-(2-氟基苯基)-3,4-二氯異噻唑-5-甲醯胺；
- 羧酸醯嗎啉類：達滅芬 (dimethomorph)、氟嗎啉 (flumorph)；
- 苄醯胺類：氟美醯胺 (flumetover)、氟吡醯菌胺 (fluopicolide)(吡考苯紫 (picobenzamid))、氯苯醯胺 (zoxamide)；
- 其他羧醯胺類：加普胺 (carpropamid)、二氯西莫 (diclocymet)、雙炔醯菌胺 (mandipropamid)、N-(2-(4-[3-(4-氯苯基)丙-2-炔氧基]-3-甲氧基苯基)乙基)-2-甲磺醯基胺基-3-甲基丁醯胺、N-(2-(4-[3-(4-氯苯基)丙-2-炔氧基]-3-甲氧基苯基)乙基)-2-乙磺醯基胺基-3-甲基丁醯

胺；

唑類

- 三唑類：比多農(bitertanol)、糠菌唑(bromuconazole)、環克唑(cyproconazole)、苯醚甲環唑(difenoconazole)、達克利(diniconazole)、伊邁唑(enilconazole)、氟環唑(epoxiconazole)、芬克唑(fenbuconazole)、護矽得(flusilazole)、氟喹唑(fluquinconazole)、護汰芬(flutriafol)、己唑醇(hexaconazole)、醯胺唑(imibenconazole)、依普克唑(ipconazole)、葉菌唑(metconazole)、邁克尼(myclobutanil)、平克唑(penconazole)、普克利(propiconazole)、丙硫醇克唑(prothioconazole)、矽氟唑(simeconazole)、得克利(tebuconazole)、氟醚唑(tetraconazole)、三泰隆(triadimenol)、三泰芬(triadimefon)、環菌唑(triticonazole)；
  - 咪唑類：賽座滅(cyazofamid)、依滅列(imazalil)、稻瘟酯(pefurazoate)、撲克拉(prochloraz)、賽福唑(triflumizole)；
  - 苯并咪唑類：免賴得(benomyl)、貝芬替(carbendazim)、麥穗靈(fuberidazole)、噻苯咪唑(thiabendazole)；
  - 其他：乙噻博胺(ethaboxam)、依得利(etridiazole)、惡黴靈(hymexazole)；
- 含氮雜環基化合物：
- 吡啶類：扶吉胺(fluzinam)、比芬諾(pyrifenox)、3-[5-

(4-氯苯基)-2,3-二甲基異噁唑啉-3-基]-吡啶；

- 嘧啶類：乙嘧吩磺酸酯 (bupirimate)、嘧菌環胺 (cyprodinil)、嘧菌脞 (ferimzone)、芬瑞莫 (fenarimol)、嘧菌胺 (mepanipyrim)、氟苯嘧啶醇 (nuarimol)、嘧黴胺 (pyrimethanil)；
- 哌啶類：賽福寧 (triforine)；
- 吡咯類：護汰寧 (fludioxonil)、拌種咯 (feniclonil)；
- 嗎啉類：阿迪嗎啉 (aldimorph)、嗎菌靈 (dodemorph)、粉鏽啉 (fenpropimorph)、三得芬 (tridemorph)；
- 二羧醯亞胺類：依普同 (iprodone)、撲滅寧 (procymidone)、免克寧 (vinclozolin)；
- 其他：酸化苯并噻二唑-S-甲酯 (acibenzolar-S-methyl)、敵菌靈 (anilazine)、蓋普丹 (captan)、四氯丹 (captafol)、邁隆 (dazomet)、噻菌清 (diclomezine)、禾草靈 (fenoxanil)、福爾培 (folpet)、苯鏽啉 (fenpropidin)、噁唑菌酮 (famoxadone)、咪唑菌酮 (fenamidone)、辛異噻唑酮 (octhilinone)、噻菌靈 (probenazole)、丙氧喹啉 (proquinazid)、百快隆 (pyroquilon)、快諾芬 (quinoxifen)、三賽唑 (tricyclazole)、5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)-[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶、2-丁氧基-6-碘-3-丙基色烯-4-酮、N,N-二甲基-3-(3-溴-6-氟-2-甲基吡啶-1-磺醯基)-[1,2,4]三唑-1-磺醯胺；

胺基甲酸酯類及二硫代胺基甲酸酯類

- 二硫代胺基甲酸酯類：福美鐵 (ferbam)、錳粉克



(mancozeb)、錳乃浦(maneb)、免得爛(metiram)、威百畝(metam)、甲基鋅乃浦(propineb)、得恩地(thiram)、鋅乃浦(zineb)、益穗(ziram)；

- 胺基甲酸酯類：乙徽威(diethofencarb)、氟苯噻瓦利(flubenthiavalicarb)、顯徽威(iprovalicarb)、霜徽威(propamocarb)、3-(4-氯苯基)-3-(2-異丙氧羰基胺基)-3-甲基丁醯基胺基)-丙酸甲酯、N-(1-(1-(4-氯基苯基)乙磺醯基)丁-2-基)-胺基甲酸4-氟苯基酯；

#### 其他殺真菌劑

- 胍類：多寧(dodine)、雙胍辛胺(iminoctadine)、雙胍鹽(guazatine)；
- 抗生素類：春日徽素(kasugamycin)、多氧菌素(polyoxins)、鏈徽素(streptomycin)、維利徽素A(validamycin A)；
- 有機金屬化合物：三苯錫(fentin)鹽；
- 含硫雜環基化合物：稻瘟靈(isoprothiolane)、腈硫醌(dithianon)；
- 有機磷化合物：護粒松(edifenphos)、福賽得(fosetyl)、乙磷鋁(fosetyl-aluminum)、丙基喜樂松(iprobenfos)、白粉松(pyrazophos)、脫克松(tolclofos-methyl)、亞磷酸及其鹽；
- 有機氯化合物：甲基多保淨(thiophanate-methyl)、四氯異苯腈(chlorothalonil)、益發靈(dichlofluanid)、益洛寧

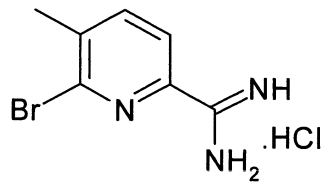
(tolylfluanid)、磺菌胺(flusulfamide)、酞內酯、六氣  
 苯、賓克隆(pencycuron)、奎脫辛(quintozene)；

- 硝基苯基衍生物：百蟎克(binapacryl)、白粉克(dinocap)、大脫蟎(dinobuton)；
- 無機活性化合物：波爾多(Bordeaux)混合物、乙酸銅、氫氧化銅、鹼性氯氧化銅(copper oxychloride)、鹼式硫酸銅、硫；
- 其他：螺環菌胺(spiroxamine)、噻芬胺(cyflufenamid)、霜脲氰(cymoxanil)、美曲芬諾(metrafenone)。

製備實例：

實例 1：5,6-二乙基-3-[6-(4-氟苯基)-5-甲基吡啶-2-基]-  
 [1,2,4]-三吡

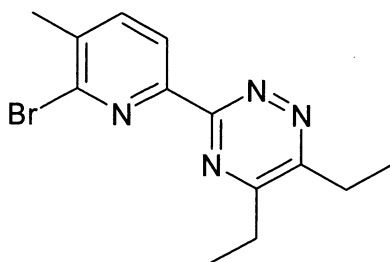
1) 6-溴-5-甲基吡啶-2-甲脒氫氯酸鹽之製備



將 2.2 g 30% 濃度之甲醇鈉於甲醇中之溶液添加至 60 ml 甲醇中之 4.90 g (25 mmol) 6-溴-5-甲基吡啶-2-腈中 [製備：參見 US 2003/0087940 A1 及 Bioorg. Med. Chem. Lett. 1571-1574 (2003)]，且於 23°C 下將混合物攪拌 7 h。接著添加 1.5 g 氯化銨，且於 23°C 下再將混合物攪拌 8 小時。移除溶劑後，添加甲基第三丁基醚(MtBE)且藉由抽吸濾出產物。產量：4.2 g，呈白色固體狀，其無需純化即進一步反應。

2) 3-(6-溴-5-甲基吡啶-2-基)-5,6-二乙基-[1,2,4]-三吡之

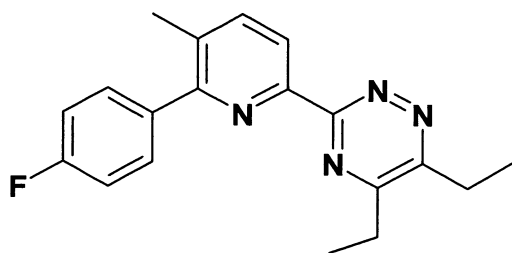
## 製備



將 2.4 g (48 mmol) 氫氧化鉀添加至 10 g (40 mmol) 步驟 1 中所製備之化合物於 100 ml 乙醇中之溶液中。30 min 後，添加 4.6 g (40 mmol) 3,4-己二酮且將混合物於回流下攪拌 5 小時且接著使其於 23°C 下靜置 12 小時。向反應溶液中添加水及正戊烷且藉由抽吸濾出所沉澱之產物。產量：9.9 g 產物。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ): 1.4 (m); 2.5 (s); 2.9 (m); 3.1 (m); 7.7 (m) 及 8.4 (m)。

3) 5,6-二乙基-3-[6-(4-氟苯基)-5-甲基吡啶-2-基]-[1,2,4]-三吡之製備



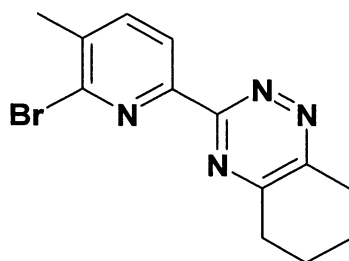
將 20 ml 水中之 0.21 g 4-氟苯基酮酸及 0.41 g 碳酸鈉相繼添加至 0.4 g 步驟 2 中所製備之化合物於 20 ml 乙二醇二甲醚中之溶液中。添加約 30 mg 二氯化[1,4-雙(二苯基膦基)丁烷]鈣(II)後，將混合物於回流下攪拌 5 小時。接著將反應溶液於水與 MtBE 之間分溶。分離有機相，於減壓下移除

溶劑且將殘餘物經使用環己烷/MtBE(1:1)之矽膠層析。其產生0.24 g產物。

熔點：108°C

實例2：3-[6-(4-氟苯基)-5-甲基吡啶-2-基]-5,6,7,8-四氫苯并-[1,2,4]-三吡

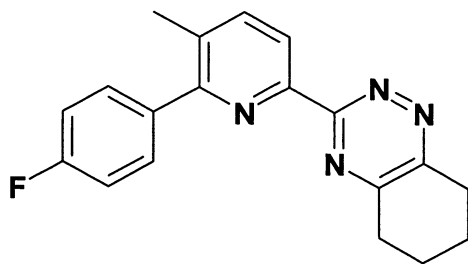
1) 3-(6-溴-5-甲基吡啶-2-基)-5,6,7,8-四氫苯并-[1,2,4]-三吡之製備



將2.4 g(48 mmol)氫氧化鉍添加至10 g(40 mmol)6-溴-5-甲基吡啶-2-甲脒氫氯酸鹽於100 ml乙醇(EtOH)中之溶液中。30 min後，添加4.5 g(40 mmol)環己烷-1,2-二酮，且將混合物於回流下攪拌7小時。接著將反應溶液於水與MtBE之間分溶，分離有機相，於減壓下移除溶劑且將殘餘物經使用環己烷/MtBE(1:1)及MtBE/EtOH(1:1)之矽膠層析。產量：5.5 g產物。

<sup>1</sup>H-NMR (δ, CDCl<sub>3</sub>): 1.9 (m); 2.5 (s); 2.8 (m); 3.1 (m); 3.2 (m); 7.7 (m)及8.45 (m)。

2) 3-[6-(4-氟苯基)-5-甲基吡啶-2-基]-5,6,7,8-四氫苯并-[1,2,4]-三吡之製備



將 20 ml 水中之 0.22 g 4-氟苯基酰胺及 0.41 g 碳酸鈉相繼添加至 0.4 g 步驟 1 中所製備之化合物於 20 ml 乙二醇二甲醚中之溶液中。添加約 30 mg 二氯化 [1,4-雙(二苯基膦基)丁烷] 鈣(II) 後，將混合物於回流下攪拌 5 小時。接著將反應溶液於水與 MtBE 之間分溶。分離有機相，於減壓下移除溶劑且將殘餘物經使用環己烷/MtBE(1:1) 之矽膠層析。其產生 0.13 g 產物。

熔點：105°C

表 1 所述之通式 I 化合物係以類似方式製備：

表 1：

序號	R <sup>5</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理資料 (°C) / [M+H] <sup>+</sup>
1	4-氟苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	108
2	4-氟苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		105
3	4-氟苯基	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	112-115
4	苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	70-73
5	4-氟苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	151-154
6	苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	193-196
7	3,4-二氟苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	139-142
8	3,4,5-三氟苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	169
9	3,5-二氟苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	158
10	3-氯-4-氟苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	120
11	3-甲基-4-氟苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	154
12	4-氟苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	133-137
13	4-甲基苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	128-130
14	4-甲氧基苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	118-120
15	4-氰基苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	171-173
16	4-甲醯基苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	122-124

序號	R <sup>5</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理資料 (°C) / [M+H] <sup>+</sup>
17	4-第三丁基苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	97-101
18	4-異丙基苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	100-103
19	4-三氟甲基苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	131-137
20	2-氟苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	103-106
21	2-氯苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	129-132
22	2-甲基苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	114-120
23	2,4-二氟苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	142-144
24	3-氟苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	95-98
25	3-甲基苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	61-64
26	3-甲氧基苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	油
27	4-乙醯基苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	124-126
28	4-乙氧基苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	103-107
29	3,4-二甲氧基苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	99-102
30	3,5-二氯苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	146-148
31	苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		161
32	4-氟苯基	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		140-143
33	3-氯-4-氟-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	124-128
34	4-苯氧基苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	125-128
35	4-硫甲基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	123-126
36	3,4-二氯-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	145-148
37	3-氯-4-甲氧基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	127-130
38	3-氟-4-乙氧基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	96-99
39	3,5-二甲基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	M+H: 333
40	3-氯-4-異丙氧基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	M+H: 397
41	3-氯-4-乙氧基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	116-119
42	2-甲氧基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	97-100
43	3-氟-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	M+H: 323
44	3-乙氧基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	89-92
45	3-氟-4-甲氧基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	117-120
46	3,4-二氟-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	121-124
47	4-乙基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	102-106
48	3,5-二氟-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	111-113
49	3-異丙氧基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	M+H: 363,2
50	2,3-二氟-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	114-117
51	2,5-二氟-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	114-118
52	2,5-二氯-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	117-120
53	3-甲基-4-氟-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	92-95
54	2,4-二甲氧基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	M+H: 365,2
55	2,3-二甲基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	125-130
56	2,5-二甲基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	M+H: 333,2
57	2-乙氧基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	89-96

序號	R <sup>5</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	物理資料 (°C) / [M+H] <sup>+</sup>
58	4-三氟甲氧基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	113-117
59	3,4,5-三氟-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	157-160
60	4-正丙氧基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	113-115
61	3-氟-4-甲基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	119-122
62	4-異丙氧基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	91-95
63	4-正丁氧基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	M+H: 377,2
64	4-氯-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		165-168
65	2-氯-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		175-178
66	2-甲基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		156-159
67	2,4-二氟-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		142-145
68	2,4-二氯-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		173-176
69	4-甲氧基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		159-163
70	2-甲氧基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		144-147
71	2-氟-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		148-152
72	2,3-二甲基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		142-145
73	2-乙基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		140-142
74	2-三氟甲基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		163-166
75	4-三氟甲基-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>		155-158
76	2-甲基-4-氟-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	M+H: 337,3
77	3-甲基-4-甲氧基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	101-108
78	3-甲基-4-氯-苯基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	105-109
79	噻吩-2-基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	141-144
80	4-甲基-噻吩-3-基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	98-102
81	6-氟-吡啶-3-基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	126-129
82	吡啶-3-基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	93-97
83	6-甲氧基-吡啶-3-基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	113-117
84	2-氯-吡啶-3-基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	93-99
85	6-氯-吡啶-3-基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	143-147
86	吡啶-4-基	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	127-130

#### 殺真菌活性測試：

將活性化合物單獨或共同製備為包含 25 mg 活性化合物之儲備溶液，使用丙酮及 / 或 二甲亞砜 (DMSO) 與乳化劑 Wettoll® EM 31 (具有乳化及分散作用、基於乙氧基化烷基酚之濕潤劑) 之混合物將其補足至 10 ml，其中溶劑 / 乳化劑之體積比為 99:1。接著以水將該混合物補足至 100 ml。將此儲備溶液以所述溶劑 / 乳化劑 / 水混合物稀釋，以產生下

文所述濃度之活性化合物。

使用實例1-抵抗源於底腐病菌(*Alternaria solani*)之番茄早疫病的活性

以具有下述活性化合物濃度之水性懸浮液將盆栽番茄植物之葉噴灑至溢流點。次日，以含有 $0.17 \times 10^6$ 孢子/毫升之2%生物麥芽水溶液中之底腐病菌孢子懸浮液接種經處理之葉。接著將測試植物置於溫度在20至22°C之飽和水蒸氣室中。5天後，未經處理但已感染之對照植物的疾病已發展至所有植物之感染可以%目測之程度。

在此測試中，經250 ppm之實例4、6、7、8、9、10、11或33之活性化合物處理之植物展示至多5%之感染，而未經處理之植物為90%感染。

使用實例2-抵抗源於灰黴孢菌(*Botrytis cinerea*)之胡椒葉灰黴病的活性，1天保護性施用

在栽培品種"Neusiedler Ideal Elite"之胡椒幼苗長全2至3片葉之後，以下述活性化合物濃度之水性懸浮液將其噴灑至溢流點。次日，以含有 $1.7 \times 10^6$ 孢子/毫升於2%生物麥芽水溶液中之灰黴孢菌孢子懸浮液接種經處理之植物。接著將測試植物置於22至24°C及高大氣濕度之氣候化暗室中。5天後，葉上之真菌感染程度可以%目測。

在此測試中，經250 ppm之實例4、6、7、8、9、10、11、31或33之活性化合物處理之植物展示至多10%之感染，而未經處理之植物為90%感染。

使用實例3-抵抗源於大麥網斑病菌(*Pyrenophora teres*)之大



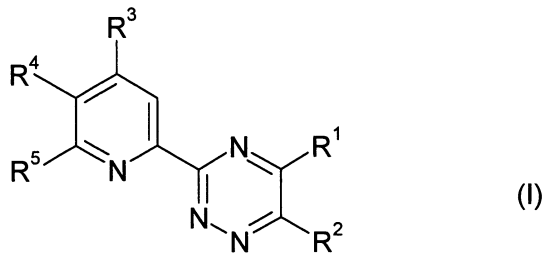
麥網狀斑點病之活性，1天保護性施用

以具有下述活性化合物濃度之水性懸浮液將盆栽大麥苗之葉噴灑至溢流點。噴灑塗覆乾燥後24小時，以大麥網斑病菌[同義內臍蠕孢](網斑病原體)之水性孢子懸浮液接種測試植物。接著將測試植物置於溫度在20與24°C之間及95至100%之相對大氣濕度的溫室中。6天後，以全葉區感染%目測疾病之進展程度。

在此測試中，經250 ppm之實例31之活性化合物處理之植物展示至多10%之感染，而未經處理之植物為90%感染。

## 五、中文發明摘要：

本發明係關於3-(吡啶-2-基)-[1,2,4]-三吡及其用於控制有害真菌之用途，且亦係關於包含此等化合物作為活性組份之農作物保護組合物，



其中：

$R^1$ 、 $R^2$  彼此獨立地為 OH、鹵素、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$ 烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$ 鹵烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$ 烷胺基或二( $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$ 烷基)胺基，

或與其所連接之碳原子一起可形成飽和5、6或7員碳環或雜環，該雜環除碳環成員以外另具有一或兩個選自由氧及硫組成之群之雜原子作為環成員，其中該碳環及該雜環為未經取代或具有1、2、3或4個 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基作為取代基；

$R^3$  為氫、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 鹵烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 環烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_6$ 環烷基甲基或鹵素；

$R^4$  為氫、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 鹵烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_4$ 鹵烷氧基或鹵素；

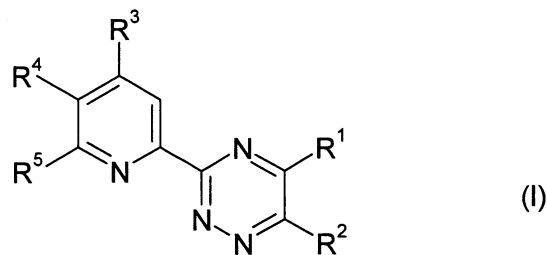
$R^5$  為 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$ 烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$ 鹵烷基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$ 烷氧基、 $\text{C}_1$ - $\text{C}_8$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$ 環烷基、 $\text{C}_3$ - $\text{C}_8$ 環烷氧基、5

或6員雜芳基、苯基、苯氧基、苄基、苄氧基、  
5或6員雜芳基甲基或5或6員雜芳氧基，其中上  
述該等環基為未經取代或可具有1、2、3、4或5  
個R<sup>a</sup>基團。

## 六、英文發明摘要：

## 十、申請專利範圍：

1. 一種通式I之3-(吡啶-2-基)-[1,2,4]-三吡化合物，



其中：

$R^1$ 、 $R^2$ 彼此獨立地為OH、鹵素、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{NH}_2$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 鹵烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷胺基或二( $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基)胺基，

或與其所連接之碳原子一起可形成飽和5、6或7員碳環或雜環，該雜環除該等碳環成員以外另具有一或兩個選自由氧及硫組成之群之雜原子作為環成員，其中該碳環及該雜環為未經取代或具有1、2、3或4個 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基作為取代基；

$R^3$ 為氫、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 環烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_6$ 環烷基甲基或鹵素；

$R^4$ 為氫、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷氧基或鹵素；

$R^5$ 為 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 鹵烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_3\text{-C}_8$ 環烷基、 $\text{C}_3\text{-C}_8$ 環烷氧基、5或6員雜芳基、苯基、苯氧基、苄基、苄氧基、5或6員雜芳基甲基或5或6員雜芳氧基，其中上述該

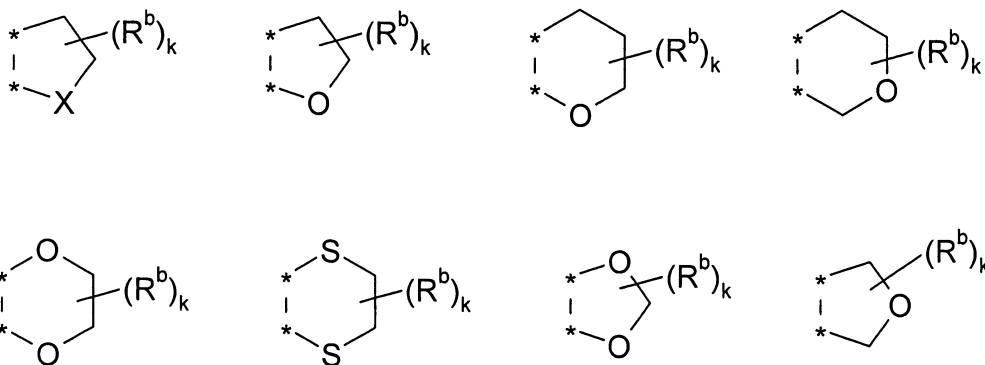
等環基為未經取代或可具有1、2、3、4或5個R<sup>a</sup>基團，其中：

R<sup>a</sup>係選自由以下各基組成之群：OH、SH、鹵素、NO<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、CN、COOH、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷胺基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基)胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基亞磺基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷基亞磺基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基磺基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷基磺基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>環烷基、苯基、苯氧基及式C(=Z)R<sup>aa</sup>之基團(其中Z為O、S、N(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基)、N(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基)、N(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>烯氧基)或N(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>炔氧基)且R<sup>aa</sup>為氫、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷氧基、NH<sub>2</sub>、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷胺基或二(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基)胺基)，或兩個連接至相鄰碳原子之R<sup>a</sup>基團與其所連接之碳原子一起亦可形成飽和5、6或7員碳環、苯環或5、6或7員雜環，該雜環除該等碳環成員以外另具有一或兩個選自由氧及硫組成之群之雜原子作為環成員，其中該碳環及該雜環為未經取代或具有1、2、3或4個C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基作為取代基；

或該式I化合物之農業上適用之鹽。

2. 如請求項1之化合物，其中R<sup>1</sup>及R<sup>2</sup>彼此獨立地選自由以下各基組成之群：氟、氯、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、甲氧基、乙氧基、CF<sub>3</sub>、CHF<sub>2</sub>、OCF<sub>3</sub>及OCHF<sub>2</sub>。
3. 如請求項1之化合物，其中R<sup>1</sup>及R<sup>2</sup>與其所連接之該三吡啶環

之該等碳原子一起形成以下環中之一者：



其中：

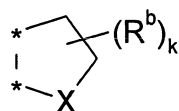
\* 為該三吡環之原子；

k 為 0、1、2、3 或 4；

$R^b$  為  $C_1$ - $C_4$  烷基；且

X 為  $(CH_2)_n$ ，其中  $n=1$ 、2 或 3 且其中若  $k \neq 0$ ，則  $(CH_2)_n$  中之 1、2、3 或 4 個氫原子可經  $R^b$  置換。

4. 如請求項 1 之化合物，其中  $R^1$  及  $R^2$  為  $C_1$ - $C_4$  烷基或與其所連接之該三吡環中之該等碳原子一起形成下式之環：



其中：

\* 為該三吡環之原子；

k 為 0、1、2、3 或 4；

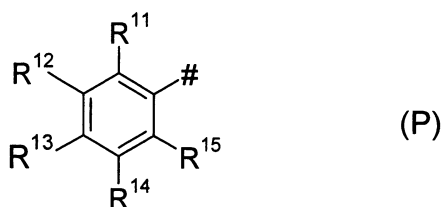
$R^b$  為  $C_1$ - $C_4$  烷基；且

X 為  $(CH_2)_n$ ，其中  $n=2$  或 3 且其中若  $k \neq 0$ ，則  $(CH_2)_n$  中之 1、2、3 或 4 個氫原子可經  $R^b$  置換。

5. 如前述請求項中任一項之化合物，其中  $R^3$  為氫、氟、

氣、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、甲氧基、乙氧基、CF<sub>3</sub>、CHF<sub>2</sub>、OCF<sub>3</sub>或OCHF<sub>2</sub>。

6. 如請求項5之化合物，其中R<sup>3</sup>為氫。
7. 如請求項5之化合物，其中R<sup>3</sup>為氣、CF<sub>3</sub>、甲基或甲氧基。
8. 如前述請求項中任一項之化合物，其中R<sup>4</sup>為氫、氣、氣、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、CF<sub>3</sub>、CHF<sub>2</sub>、OCF<sub>3</sub>或OCHF<sub>2</sub>。
9. 如請求項8之化合物，其中R<sup>4</sup>為氫、氣、氣或甲基。
10. 如前述請求項中任一項之化合物，其中R<sup>a</sup>係選自由以下各基組成之群：鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧羰基及式C(=N-O-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基)R<sup>aa</sup>之基團，其中R<sup>aa</sup>為氫或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基。
11. 如前述請求項中任一項之化合物，其中R<sup>5</sup>為苯基、苯氧基或苄基，其中該苯環具有1、2、3、4或5個R<sup>a</sup>基團。
12. 如請求項10之化合物，其中苯基、苯氧基或苄基中之該苯環具有通式P：



其中#為與其餘分子之連接點；

R<sup>11</sup> 為氫、氣、氣、CH<sub>3</sub>、OCH<sub>3</sub>、OCHF<sub>2</sub>、OCF<sub>3</sub>或CF<sub>3</sub>；

R<sup>12</sup>、R<sup>14</sup>彼此獨立地為氫、氣、氣、CH<sub>3</sub>、OCH<sub>3</sub>、

OCHF<sub>2</sub>、OCF<sub>3</sub>或CF<sub>3</sub>，其中該等基團R<sup>12</sup>及R<sup>14</sup>中之一者亦可為NO<sub>2</sub>、C(O)CH<sub>3</sub>或COOCH<sub>3</sub>；

R<sup>13</sup> 為氫、氟、氯、氰基、OH、CHO、NO<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>、甲胺基、二甲胺基、二乙胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>鹵烷氧基、CO(A<sup>2</sup>)(其中A<sup>2</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷氧基)或基團C(R<sup>13a</sup>)=NOR<sup>13b</sup>(其中R<sup>13a</sup>為氫或甲基且R<sup>13b</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、炔丙基或烯丙基，或R<sup>12</sup>及R<sup>13</sup>一起形成基團O-CH<sub>2</sub>-O)；且

R<sup>15</sup> 為氫、氟、氯或C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基。

13. 如請求項1至9中任一項之化合物，其中R<sup>5</sup>為C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基或C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>鹵烷基。
14. 如請求項1至9中任一項之化合物，其中R<sup>5</sup>係選自由以下各基組成之群：具有1、2、3或4個氮原子或1個選自由氧及硫組成之群之雜原子及視情況選用1、2或3個氮原子作為環原子的5員雜芳基及具有1、2、3或4個氮原子作為環成員之6員雜芳基，其中5及6員雜芳基可具有1、2、3或4個R<sup>a</sup>取代基。
15. 如請求項14之化合物，其中R<sup>5</sup>係選自由以下各基組成之群：咪喃基、噻吩基、吡啶基及嘓啶基，該等基團在各情況下均為未經取代或具有1、2或3個R<sup>a</sup>取代基。
16. 一種以如請求項1至15中任一項之式I化合物或其鹽用於控制植物病原性真菌之用途。
17. 一種農作物保護組合物，其包含固體或液體載劑及如請



求項1至15中任一項之式I化合物及/或其鹽。

18. 一種種子，其包含至少一種如請求項1至15中任一項之式I化合物及/或其鹽。
19. 一種控制植物病原性真菌之方法，其中該真菌或待保護以免於真菌侵襲之材料、植物、土壤或種子係經有效量之如請求項1至15中任一項之式I化合物或其鹽處理。

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：( 無 )

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

