



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 202321233 A

(43)公開日：中華民國 112 (2023) 年 06 月 01 日

(21)申請案號：111128781

(22)申請日：中華民國 111 (2022) 年 08 月 01 日

(51)Int. Cl.：

C07D413/14 (2006.01)

C07D417/14 (2006.01)

A01N43/824 (2006.01)

A01N43/80 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

(30)優先權：2021/08/02

歐洲專利局

21189099.1

2022/02/02

歐洲專利局

22154772.2

(71)申請人：瑞士商先正達農作物保護公司(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)；威廉斯 西蒙 WILLIAMS, SIMON (GB)；裘格 皮耳 約瑟 瑪瑟爾 JUNG, PIERRE JOSEPH MARCEL (FR)；芬克拜納 彼得 FINKBEINER, PETER (DE)；保利奧 馬丁 POULIOT, MARTIN (CA)；格羅舍瓦 達里亞 GROSHEVA, DARIA (RU)；蘇塞 拉爾斯 SUESSE, LARS (DE)；布魯諾 紀堯姆 BRUNOT, GUILLAUME (FR)；邦瓦洛 達米安 BONVALOT, DAMIEN (FR)

(74)代理人：閻啓泰；林景郁

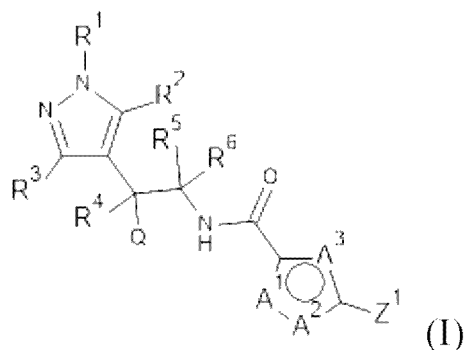
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：15 項 圖式數：0 共 162 頁

(54)名稱

殺微生物之吡唑衍生物

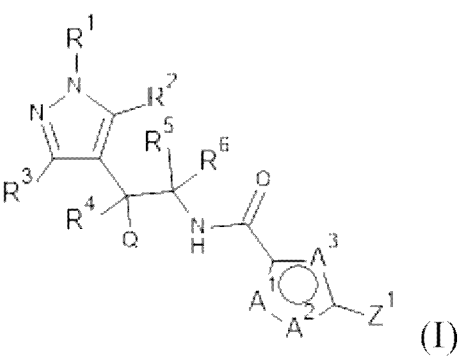
(57)摘要

一種具有式 (I) 之化合物：



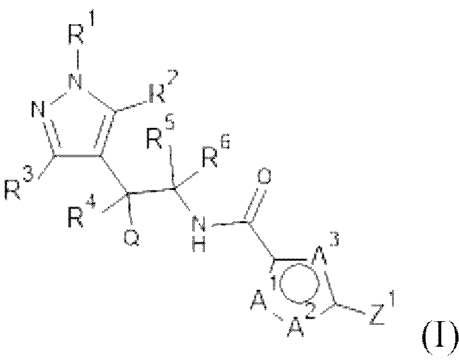
其中其取代基係如在申請專利範圍請求項 1 中所定義的，以及該等化合物的農用化學上可接受的鹽、立體異構物、鏡像異構物、互變異構物和 N-氧化物，其可以用作殺真菌劑。

A compound of formula (I):



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.

特徵化學式：



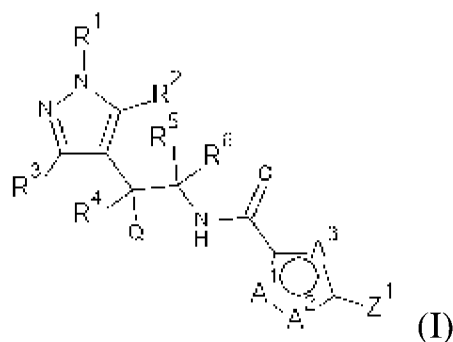
【發明摘要】

【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】

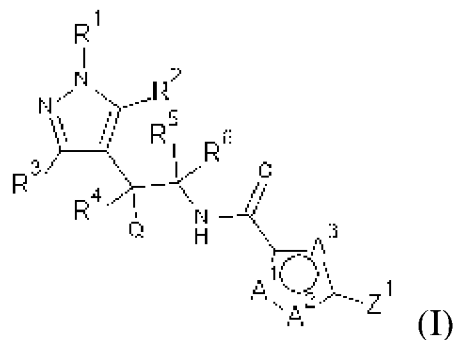
一種具有式 (I) 之化合物：



其中其取代基係如在申請專利範圍請求項1中所定義的，以及該等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):



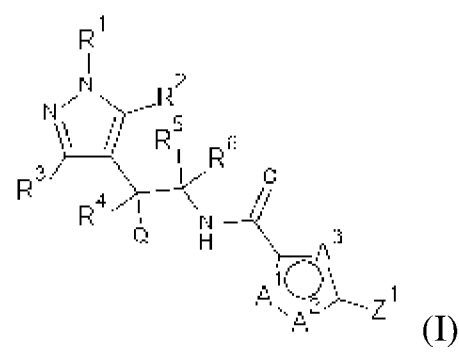
wherein the substituents are as defined in claim 1, and the agrochemically acceptable salts, stereoisomers, enantiomers, tautomers and N-oxides of those compounds, which can be used as fungicides.

【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】

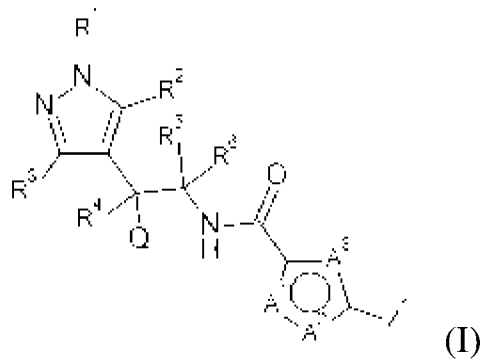
【0001】 本發明關於殺微生物的吡唑衍生物，例如作為活性成分，其具有殺微生物活性，特別是殺真菌活性。本發明還關於該等吡唑衍生物的製備，關於在該等吡唑衍生物的製備中有用的中間體，關於該等中間體的製備，關於包括該等吡唑衍生物中的至少一種的農用化學組成物，關於該等組成物的製備並且關於該等吡唑衍生物或組成物在農業或園藝中用於控制或防止植物、收穫的糧食作物、種子或非生命材料被植物病原性微生物，特別是真菌侵染之用途。

【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) 之化合物：



其中

R¹選自由以下者組成之群組：氫、C₁-C₄烷基、C₂-C₄烯基、C₂-C₄炔基和C₃-C₆環烷

基；

R²選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄烷基、C₂-C₄烯基、C₂-C₄炔基、C₁-C₄鹵代烷基、C₃-C₆環烷基、C₁-C₄烷基羰基、N-C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄烷基-碳醯亞胺基、N-羥基-C₁-C₄烷基-碳醯亞胺基和C₁-C₄烷氧基羰基；

R³選自由以下者組成之群組：氫、鹵素和C₁-C₄烷基；

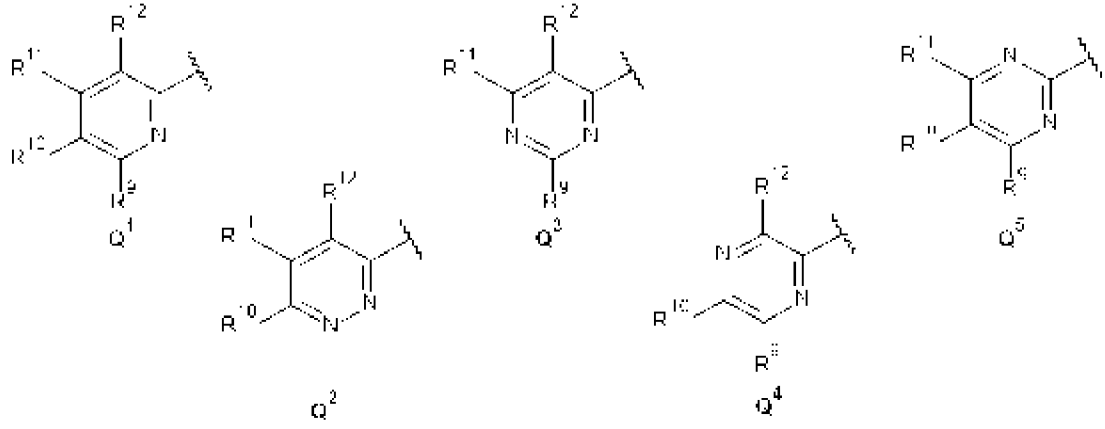
R⁴選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄烷基、氰基、C₁-C₄烷基羰基、C₁-C₄烷氧基羰基、C₁-C₄烷基胺基羰基和二(C₁-C₄烷基胺基)羰基；

R⁵和R⁶獨立地選自由以下者組成之群組：氫和C₁-C₄烷基；

A¹、A²和A³獨立地選自由CR⁷、N、NR⁸、O和S組成之群組，其前提係A¹、A²和A³中的至少一者選自N、O和S，並且A¹、A²和A³中不超過一個係O或S；

R⁷和R⁸獨立地選自由以下者組成之群組：氫、C₁-C₄烷基、C₂-C₄烯基和C₂-C₄炔基；

Q選自由以下者組成之群組：Q¹、Q²、Q³、Q⁴和Q⁵：



其中

R⁹、R¹⁰、R¹¹和R¹²獨立地選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、胺基、羥基、羧酸、氰基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵代烷氧基、C₂-C₄烯氧基、C₂-C₄炔氧基、C₁-C₄烷基氫硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基、C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄烷基、N-C₁-C₄烷基胺基、N,N-二C₁-C₄烷基胺基、C₁-C₆烷氧基羰基、C₁-C₄烷基羰基、N-C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄烷基-碳醯亞胺基、N-羥基-C₁-C₄烷基-碳醯亞胺基、C₁-C₄烷基胺基羰基、二(C₁-C₄烷基胺基)羰基、C₁-C₄烷基羰

基胺基、C₁-C₄烷基磺醯基胺基、三氟甲基磺醯基氧基、苯基、5員或6員雜芳基和C₃-C₆環烷基，其中該5員或6員雜芳基包含1、2、3或4個單獨地選自N、O和S的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和C₃-C₆環烷基中的任一者視需要被1、2或3個獨立地選自鹵素、氰基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵代烷基和C₁-C₄烷氧基的取代基取代；並且

Z¹選自由以下者組成之群組：C₁-C₄烷基、苯基、5員或6員雜芳基和C₃-C₆環烷基，其中該5員或6員雜芳基包含1、2、3或4個單獨選自N、O和S的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和C₃-C₆環烷基中的任一者視需要被1、2或3個獨立地選自鹵素、氰基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵代烷氧基、C₁-C₄烷基氫硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基和C₂-C₄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。

【0004】 出人意料地，已經發現了，出於實際目的，具有式 (I) 之化合物具有非常有利水平的用來保護植物免受由真菌引起的疾病的生物活性。

【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) 之化合物、或包含該具有式 (I) 之化合物的組成物施用於該植物、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) 之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。

【0008】 如本文使用的，術語「鹵素 (halogen或halo)」係指氟 (fluorine, fluoro)、氯 (chlorine, chloro)、溴 (bromine, bromo) 或碘 (iodine, iodo)，較佳的是氟、氯或溴。

【0009】 如本文使用的，胺基意指-NH₂基團。

【0010】 如本文使用的，氰基意指-CN基團。

【0011】 如本文使用的，術語「羥基 (hydroxyl或hydroxy)」意指-OH基團。

【0012】 如本文使用的，術語「羧酸」意指-COOH基團。

【0013】 如本文使用的，側氧基意指=O基團，例如，亞磺醯基 (-S(O)-) 或磺醯基 (-S(O)₂-) 氧。

【0014】 如本文使用的，術語「C₁-C₄烷基」係指僅由碳原子和氫原子組成的直鏈的或支鏈的烴鏈基團，該烴鏈基團不含不飽和度、具有從一至四個碳原子、並且藉由單鍵附接至分子的其餘部分。術語「C₁-C₃烷基」和「C₁-C₂烷基」應被相應地解釋。C₁-C₄烷基的實例包括但不限於甲基、乙基、正丙基、1-甲基乙基 (異丙基)、正丁基和1,1-二甲基乙基 (三級丁基)。「C₁-C₄伸烷基」基團係指C₁-C₄烷基的相應定義，不同之處在於此種基團係藉由兩個單鍵附接至分子的其餘部分。C₁-C₄伸烷基的實例係-CH₂-和-CH₂CH₂-。

【0015】 如本文使用的，術語「C₂-C₄烯基」係指僅由碳原子和氫原子組成的直鏈或支鏈的烴鏈基團，該烴鏈基團含有至少一個可以具有(E)或(Z)組態的雙鍵、具有從二至四個碳原子、藉由單鍵附接至分子的其餘部分。術語「C₃-C₄烯基」應相應地解釋。C₂-C₄烯基的實例包括但不限於乙烯基和丙-1-烯基。

【0016】 如本文使用的，術語「C₂-C₄炔基」係指僅由碳原子和氫原子組成的直鏈或支鏈的烴鏈基團，該烴鏈基團含有至少一個三鍵、具有從二至四個碳原子、並且藉由單鍵附接至分子的其餘部分。術語「C₃-C₄炔基」應相應地解釋。

C₃-C₄炔基的實例包括但不限於乙炔基、丙-1-炔基、炔丙基（丙-2-炔基）、丁-1-炔基和3-甲基-丁-1-炔基。

【0017】 如本文使用的，術語「C₁-C₄鹵代烷基」係指被一個或多個相同的或不同的鹵素原子取代的如上通常定義的C₁-C₄烷基基團。C₁-C₄鹵代烷基的實例包括但不限於氟甲基、氟乙基、氯乙基、二氟甲基、二氯乙基、三氟甲基、氟丙基、氯丙基、二氟丙基、二氯丙基、三氟丙基、三氯丙基、2,2-二氟乙基、2,2-二氯乙基、2,2,2-三氟乙基、和3,3,3-三氟丙基。

【0018】 如本文使用的，術語「C₁-C₄烷氧基」係指具有式R_aO-的基團，其中R_a係如上通常定義的C₁-C₄烷基基團。術語「C₁-C₃烷氧基」和「C₁-C₂烷氧基」應相應地解釋。C₁-C₄烷氧基的實例包括但不限於甲氧基、乙氧基、丙氧基、異丙氧基、和三級丁氧基。

【0019】 如本文使用的，術語「C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄烷基」係指具有式R_b-O-R_a的基團，其中R_b係如上通常定義的C₁-C₄烷基基團，並且R_a係如上通常定義的C₁-C₄伸烷基基團。

【0020】 如本文使用的，術語「C₁-C₄烷基羰基」係指具有式-C(O)R_a的基團，其中R_a係如上通常定義的C₁-C₄烷基基團。

【0021】 如本文使用的，術語「C₁-C₄烷氧基羰基」係指具有式-C(O)OR_a的基團，其中R_a係如上通常定義的C₁-C₄烷基基團。

【0022】 如本文使用的，術語「N-C₁₋₄烷基胺基」係指具有式-NH-R_a的基團，其中R_a係如上定義的C₁₋₄烷基基團。

【0023】 如本文使用的，術語「N,N-二C₁₋₄烷基胺基」係指具有式-N(R_a)R_a的基團，其中每個R_a係如上定義的可以相同或不同的C₁₋₄烷基基團。

【0024】 如本文使用的，術語「C₁-C₄烷基胺基羰基」係指具有式-C(O)NHR_a的基團，其中R_a係如上通常定義的C₁-C₄烷基基團。

【0025】 如本文使用的，術語「二(C₁-C₄烷基胺基)羰基」係指具有式-C(O)NR_a(R_a)的基團，其中每個R_a係如上通常定義的可以相同或不同的C₁-C₄烷基基團。

【0026】 如本文使用的，術語「C₁-C₄烷基磺醯基胺基」係指具有式-NH-S(O)₂R_a的基團，其中R_a係如上通常定義的C₁-C₄烷基基團。

【0027】 如本文使用的，術語「C₂-C₄烯氧基」係指具有式-OR_a的基團，其中R_a係如上通常定義的C₂-C₄烯基基團。

【0028】 如本文使用的，術語「C₂-C₄炔氧基」係指具有式-OR_a的基團，其中R_a係如上通常定義的C₂-C₄炔基基團。

【0029】 如本文使用的，術語「N-C₁-C₄烷氧基-C-C₁-C₄烷基-碳醯亞胺基」係指具有式-C(R_a)=NO(R_b)的基團，其中R_a係如上通常定義的C₁-C₄烷基基團，並且R_b係如上通常定義的C₁-C₄烷基基團。

【0030】 如本文使用的，術語「N-羥基-C-C₁-C₄烷基-碳醯亞胺基」係指具有式-C(R_a)=NOH的基團，其中R_a係如上通常定義的C₁-C₄烷基基團。

【0031】 如本文使用的，術語「C₃-C₆環烷基」係指飽和或部分不飽和並且含有3至6個碳原子的穩定的單環基團。術語「C₃-C₄環烷基」和「C₃-C₅環烷基」應相應地解釋。C₃-C₆環烷基的實例包括但不限於環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環戊烯-1-基、環戊烯-3-基、和環己烯-3-基。

【0032】 如本文使用的，術語「C₃-C₆環烷基C₁-C₄烷基」係指藉由如上定義的C₁-C₄伸烷基基團附接至分子的剩餘部分的如上定義的C₃-C₆環烷基環。C₃-C₆環烷基C₁-C₄烷基的實例包括但不限於環丙基-甲基、環丁基-乙基、和環戊基-甲基。

【0033】 包含1至4個獨立地選自氮、氧和硫的雜原子的5員或6員雜芳基環的實例包括但不限於吡啶基、嘧啶基、吡咯基、吡唑基、呋喃基、噻吩基、咪唑

基、異噁唑基、噁唑基、噻唑基、異噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基、吡啶基、嗒吡基和三吡基。

【0034】 具有至少一個鹼性中心的根據本發明之具有式 (I) 之化合物或者具有式 (III) 之中間體化合物可以例如與以下者形成例如酸加成鹽：強無機酸（如礦物酸，例如過氯酸、硫酸、硝酸、磷酸或氫鹵酸）、強有機羧酸（如未經取代的或經取代（例如被鹵素取代）的C₁-C₄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，如羧基羧酸，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（如未經取代的或經取代（例如被鹵素取代）的C₁-C₄烷磺酸或芳基磺酸，例如甲烷磺酸或對甲苯磺酸）。

【0035】 具有至少一個酸性基團的根據本發明之具有式 (I) 之化合物或者具有式 (III) 之中間體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；或與氨或有機胺（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。

【0036】 在根據本發明之具有式 (I) 之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。作為圍繞單鍵的受限旋轉的結果，還可能存在阻轉異構物。式 (I) 旨在包括所有可能的異構物形式及其混合物。本發明包括根據本發明之具有式 (I) 之化合物的所有可能的異構物形式及其混合物。同樣地，具有式 (I) 之化合物旨在包括所有可能的互變異構物（包括內醯胺-內醯亞胺互變異構和酮-烯醇互變異構）（當存在時）。本發明包括根據本發明之具有式 (I) 之化合物的所有可能的互變異構物形式。

【0037】 在每種情況下，根據本發明之具有式 (I) 之化合物係呈游離形

式、氧化形式（呈N-氧化物）、共價水合形式、或鹽形式（例如農藝學上可用的或農用化學上可接受的鹽形式）。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，A. Albini和S. Pietra於1991年在博卡拉頓（Boca Raton）CRC出版社出版的名為「Heterocyclic N-oxides [雜環N-氧化物]」一書中描述了其等。可以藉由使具有式 (I) 之化合物與合適的氧化劑（例如H₂O₂/尿素加合物）在酸酐（例如，三氟乙酸酐）存在下反應製備N-氧化物。此類氧化從文獻，例如從*J. Med. Chem. [藥物化學雜誌]*, **1989**, 32 (12), 2561-73或WO 2000/15615已知。根據本發明之具有式 (I) 之化合物還包括在鹽形成期間可以形成的水合物。

【0038】 以下清單提供了關於本發明之具有式 (I) 之化合物的取代基R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、A¹、A²、A³、Q（Q¹、Q²、Q³、Q⁴和Q⁵）和Z¹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中的其他地方給出的任何其他取代基的任何定義。

【0039】 在本發明之一個實施方式中，R¹係C₁-C₄烷基。較佳的是，R¹係甲基、乙基或異丙基。更佳的是，R¹係甲基。

【0040】 在本發明之一個實施方式中，R²選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄烷基、C₃-C₆環烷基、C₁-C₄烷基羰基、N-C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄烷基-碳醯亞胺基和N-羥基-C₁-C₄烷基-碳醯亞胺基。較佳的是，R²選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、甲基、乙基、環丙基、C₁-C₂烷基羰基、N-C₁-C₂烷氧基-C₁-C₂烷基-碳醯亞胺基和N-羥基-C₁-C₂烷基-碳醯亞胺基。更佳的是，R²選自由以下者組成之群組：氫、氟、氯、溴、甲基、乙基、環丙基、乙醯基、-C(CH₃)=NOCH₃、-C(CH₃)=NOCH₂CH₃和-C(CH₃)=NOH。甚至更佳的是，R²選自由以下者組成之群組：氫、氟、氯和甲基。

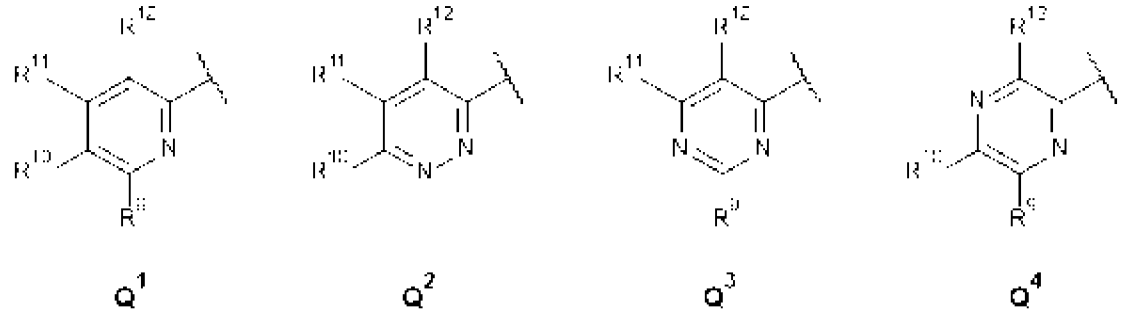
【0041】 在本發明之一個實施方式中，R³選自由以下者組成之群組：氫、

氟、氯和甲基。更佳的是， R^3 係氫。

【0042】 在本發明之一個實施方式中， R^4 選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、 C_1 - C_4 烷基、氰基和 C_1 - C_4 烷氧基羰基。較佳的是， R^4 選自由以下者組成之群組：氫、氯、氟、甲基、乙基、異丙基、氰基和 $-CO_2Me$ 。更佳的是， R^4 選自由以下者組成之群組：氫、氰基或 C_1 - C_4 烷基。甚至更佳的是， R^4 選自由以下者組成之群組：氫、甲基、乙基、異丙基和氰基。甚至更佳的是， R^4 係氫或甲基。

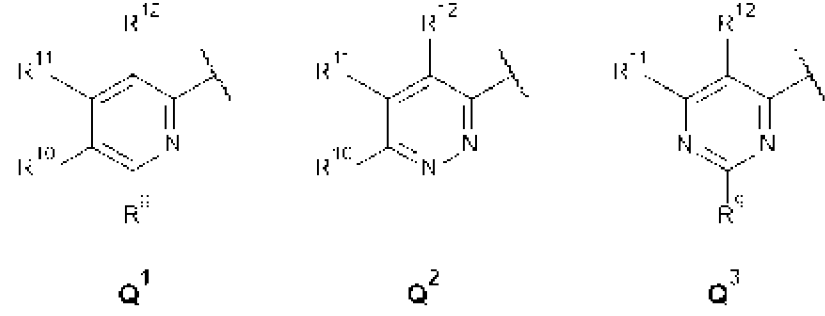
【0043】 在本發明之一個實施方式中， R^5 和 R^6 獨立地選自由以下者組成之群組：氫、甲基和乙基。較佳的是， R^5 和 R^6 獨立地選自由以下者組成之群組：氫和甲基。更佳的是， R^5 和 R^6 係氫。

【0044】 在本發明之一個實施方式中， Q 選自由以下者組成之群組： Q^1 、 Q^2 、 Q^3 和 Q^4 ：



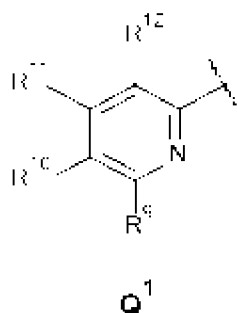
其中 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 和 R^{12} 係如上所定義的。

【0045】 較佳的是， Q 選自由以下者組成之群組： Q^1 、 Q^2 和 Q^3 ：



其中 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 和 R^{12} 係如上所定義的。

【0046】 更佳的是， Q 係 Q^1 ：



其中R⁹、R¹⁰、R¹¹和R¹²係如上所定義的。

【0047】 在本發明之一個實施方式中，R⁹和R¹⁰獨立地選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、胺基、羥基、羧酸、氰基、C₁-C₃烷基、C₁-C₂鹵代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₃鹵代烷氧基、C₂-C₃烯氧基、C₂-C₃炔氧基、C₁-C₂烷基氫硫基、C₁-C₂烷基亞磺醯基、C₁-C₂烷基磺醯基、C₁-C₂烷氧基-C₁-C₂烷基、N-C₁₋₄烷基胺基、N,N-二C₁₋₄烷基胺基、C₁-C₃烷氧基羰基、C₁-C₂烷基羰基、N-C₁-C₂烷氧基-C₁-C₂烷基-碳醯亞胺基、N-羥基-C₁-C₂烷基-碳醯亞胺基、C₁-C₂烷基胺基羰基、二(C₁-C₂烷基胺基)羰基、C₁-C₂烷基羰基胺基、C₁-C₂烷基磺醯基胺基、三氟甲基磺醯基氧基、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、3-氯吡咯-1-基、4-(三氟甲基)吡唑-1-基、3-(三氟甲基)吡唑-1-基、3-氰基吡唑-1-基、4-氰基吡唑-1-基、5-氯吡唑-1-基、4-氯吡唑-1-基、3-氯吡唑-1-基、5-氟吡唑-1-基、4-氟吡唑-1-基、3-氟吡唑-1-基、3,5-二甲基吡唑-1-基、5-甲基吡唑-1-基、4-甲基吡唑-1-基、3-甲基吡唑-1-基、吡唑-1-基、環丙基和1-氰基環丙基。

【0048】 在本發明之另一個實施方式中，R⁹和R¹⁰獨立地選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、胺基、羧酸、氰基、C₁-C₃烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵代烷基、C₁-C₄烷氧基羰基、C₁-C₂烷基磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基胺基、C₁-C₄烷基羰基胺基、二(C₁-C₄烷基胺基)羰基、N-C₁-C₂烷氧基-C₁-C₂烷基-碳醯亞胺基、C₁-C₄烷基羰基和C₁-C₄烷基羰基胺基、5員或6員雜芳基和C₃-C₆環烷基，其中該5員或6員雜芳基包含1、2、3或4個單獨地選自N、O和S的雜原子，並且其中所述苯

基、5員或6員雜芳基和C₃-C₆環烷基中的任一者視需要被1、2或3個獨立地選自鹵素、氰基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵代烷基和C₁-C₄烷氧基的取代基取代。

【0049】 在本發明之又另一個實施方式中，R⁹和R¹⁰獨立地選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、胺基、羧酸、氰基、C₁-C₃烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵代烷基、C₁-C₄烷氧基羰基、C₁-C₂烷基磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基胺基、C₁-C₄烷基羰基胺基、二(C₁-C₄烷基胺基)羰基、N-C₁-C₂烷氧基-C-C₁-C₂烷基-磺醯亞胺基、C₁-C₄烷基羰基和C₁-C₄烷基羰基胺基、5員或6員雜芳基和C₃-C₆環烷基，其中該5員或6員雜芳基包含1或2個單獨地選自N、O和S的雜原子，並且其中所述5員或6員雜芳基和C₃-C₆環烷基中的任一者視需要被1、2或3個獨立地選自鹵素、氰基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵代烷基和C₁-C₄烷氧基的取代基取代。較佳的是，R⁹和R¹⁰獨立地選自由以下者組成之群組：氫、氯、氟、溴、胺基、羧酸、氰基、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、乙基磺醯基、二甲基胺基、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、-C(CH₃)=NOCH₃、-C(CH₃)=NOCH₂CH₃、-C(CH₃)=NOH、甲基胺基羰基、二(甲基胺基)羰基、甲基羰基胺基、甲基磺醯基胺基、三氟甲基磺醯基氧基、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、3-氯吡咯-1-基、4-(三氟甲基)吡唑-1-基、3-(三氟甲基)吡唑-1-基、3-氰基吡唑-1-基、4-氰基吡唑-1-基、5-氯吡唑-1-基、4-氯吡唑-1-基、3-氯吡唑-1-基、5-氟吡唑-1-基、4-氟吡唑-1-基、3-氟吡唑-1-基、3,5-二甲基吡唑-1-基、5-甲基吡唑-1-基、4-甲基吡唑-1-基、3-甲基吡唑-1-基、吡唑-1-基、環丙基和1-氰基環丙基。

【0050】 更佳的是，R⁹和R¹⁰獨立地選自由以下者組成之群組：氫、氯、氟、溴、胺基、羧酸、氰基、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、乙基磺醯基、二甲基胺基、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、 $-C(CH_3)=NOCH_3$ 、 $-C(CH_3)=NOCH_2CH_3$ 、 $-C(CH_3)=NOH$ 、甲基胺基羰基、二(甲基胺基)羰基、甲基羰基胺基、甲基磺醯基胺基和三氟甲基磺醯基氧基。

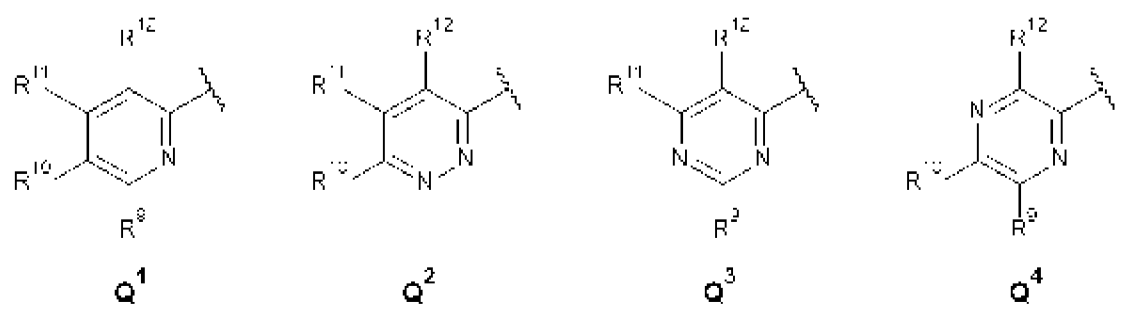
【0051】 在本發明之一個實施方式中， R^{11} 選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_2 - C_4 烯氧基、 C_1 - C_4 烷基羰基和N- C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基-碳醯亞胺基。

【0052】 在本發明之另一個實施方式中， R^{11} 選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 烷氧基。較佳的是， R^{11} 選自由以下者組成之群組：氫、氯、氟、溴、羥基、氰基、甲基和甲氧基。

【0053】 在一個實施方式中， R^{12} 選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 烷基羰基和N- C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 烷基-碳醯亞胺基。

【0054】 在另一個實施方式中， R^{12} 選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、 C_1 - C_4 烷基和 C_1 - C_4 烷氧基。在本發明之還另一個實施方式中， R^{12} 選自由以下者組成之群組：氫、鹵素和 C_1 - C_4 烷基。較佳的是， R^{12} 選自由以下者組成之群組：氫、氯、氟、溴和甲基。

【0055】 在本發明之一個實施方式中，Q選自由以下者組成之群組： Q^1 、 Q^2 、 Q^3 和 Q^4 ：



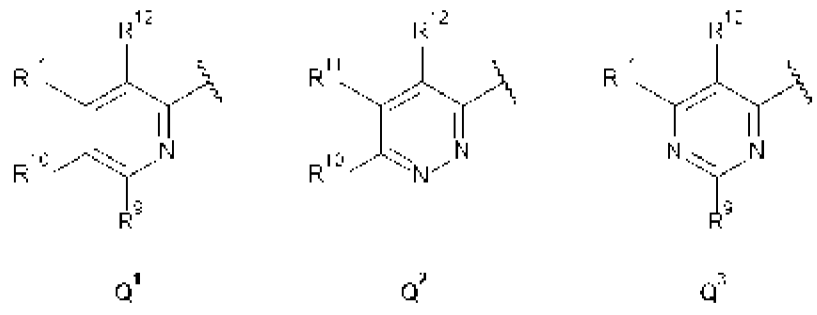
其中

R⁹和R¹⁰獨立地選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、胺基、羥基、羧酸、氰基、C₁-C₃烷基、C₁-C₂鹵代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₃鹵代烷氧基、C₂-C₃烯氧基、C₂-C₃炔氧基、C₁-C₂烷基氫硫基、C₁-C₂烷基亞磺醯基、C₁-C₂烷基磺醯基、C₁-C₂烷氧基-C₁-C₂烷基、N-C₁₋₄烷基胺基、N,N-二C₁₋₄烷基胺基、C₁-C₃烷氧基羰基、C₁-C₂烷基羰基、N-C₁-C₂烷氧基-C₁-C₂烷基-碳醯亞胺基、N-羥基-C₁-C₂烷基-碳醯亞胺基、C₁-C₂烷基胺基羰基、二(C₁-C₂烷基胺基)羰基、C₁-C₂烷基羰基胺基、C₁-C₂烷基磺醯基胺基、三氟甲基磺醯基氧基、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、3-氯吡咯-1-基、4-(三氟甲基)吡唑-1-基、3-(三氟甲基)吡唑-1-基、3-氰基吡唑-1-基、4-氰基吡唑-1-基、5-氯吡唑-1-基、4-氯吡唑-1-基、3-氯吡唑-1-基、5-氟吡唑-1-基、4-氟吡唑-1-基、3-氟吡唑-1-基、3,5-二甲基吡唑-1-基、5-甲基吡唑-1-基、4-甲基吡唑-1-基、3-甲基吡唑-1-基、吡唑-1-基、環丙基和1-氰基環丙基；

R¹¹選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、羥基、氰基、C₁-C₄烷基和C₁-C₄烷氧基；
並且

R¹²選自由以下者組成之群組：氫、鹵素和C₁-C₄烷基。

【0056】 較佳的是，Q選自由以下者組成之群組：Q¹、Q²和Q³：



其中

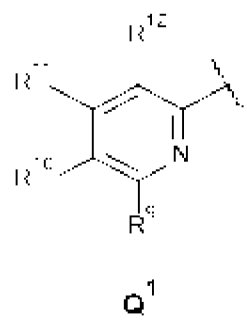
R⁹和R¹⁰獨立地選自由以下者組成之群組：氫、氯、氟、溴、胺基、羧酸、氰基、甲基、乙基、三氟甲基、二氟甲基、二氟甲氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙

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、乙基磺醯基、二甲基胺基、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、 $-C(CH_3)=NOCH_3$ 、 $-C(CH_3)=NOCH_2CH_3$ 、 $-C(CH_3)=NOH$ 、甲基胺基羰基、二(甲基胺基)羰基、甲基羰基胺基、甲基磺醯基胺基和三氟甲基磺醯基氧基；

R^{11} 選自由以下者組成之群組：氫、氯、氟、溴、羥基、氰基、甲基和甲氧基；並且

R^{12} 選自由以下者組成之群組：氫、氯、氟、溴和甲基。

【0057】 更佳的是， Q 係 Q^1 ：



其中

R^9 和 R^{10} 獨立地選自由以下者組成之群組：氫、氯、氟、溴、胺基、羧酸、氰基、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、乙基磺醯基、二甲基胺基、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、 $-C(CH_3)=NOCH_3$ 、 $-C(CH_3)=NOCH_2CH_3$ 、 $-C(CH_3)=NOH$ 、甲基胺基羰基、二(甲基胺基)羰基、甲基羰基胺基、甲基磺醯基胺基和三氟甲基磺醯基氧基；

R^{11} 選自由以下者組成之群組：氫、氯、氟、溴、羥基、氰基、甲基和甲氧基；並且

R^{12} 選自由以下者組成之群組：氫、氯、氟、溴和甲基。

【0058】 在本發明之一個實施方式中， A^1 、 A^2 和 A^3 獨立地選自由 CR^7 、N、O和S組成之群組，其前提係 A^1 、 A^2 和 A^3 中的至少一者選自N、O和S，並且 A^1 、 A^2 和 A^3 中不超過一個係O或S。

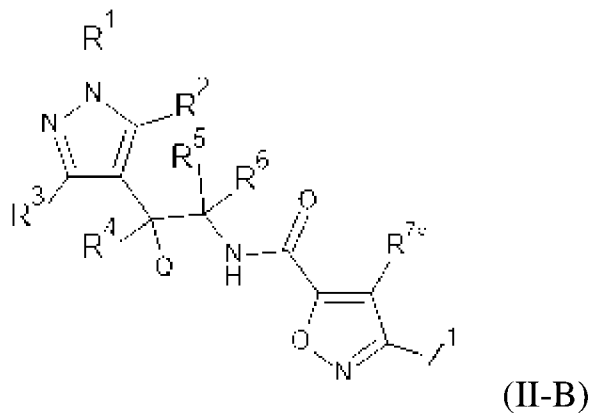
【0059】 在本發明之一個實施方式中， R^7 係氫或甲基。

【0060】 在本發明之一個實施方式中， R^8 係氫或甲基。

【0061】 在本發明之一個實施方式中， Z^1 選自由以下者組成之群組：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、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、2-呋喃基、2-噻吩基、3-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、正丙基和苯基。較佳的是， Z^1 選自由以下者組成之群組：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、甲基和苯基。更佳的是， Z^1 選自由以下者組成之群組：1-甲基吡啶-4-基、2,4,6-三氟苯基、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、環戊基和甲基。甚至更佳的是， Z^1 選自由以下者組成之群組：2,4-二氟苯基、2-氟苯基、4-氟苯基和苯基。

【0062】 在本發明之一個實施方式中，具有式 (I) 之化合物可以是具有式 (II) 之化合物：

有式 (II-B) 之化合物，其中A係A-10：



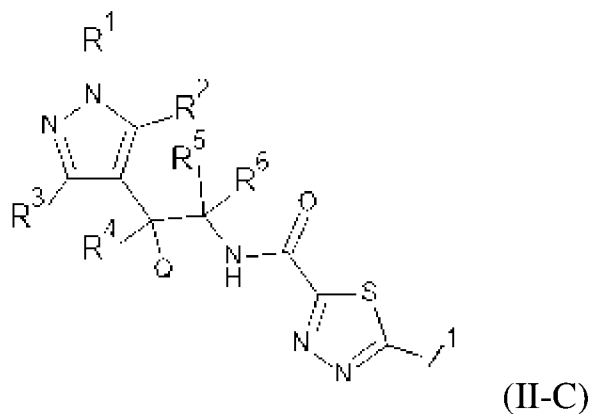
其中R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R^{7c}、Q和Z¹係如對於根據本發明之具有式 (I) 之化合物所定義的。

【0076】 在本發明之該實施方式的變體中，具有式 (II) 之化合物可以是具有式 (II-B) 之化合物，其中Q係Q¹。

【0077】 較佳的是，在本發明之具有式 (II-B) 之化合物中，
R¹係C₁-C₄烷基，較佳的是甲基、乙基或異丙基，
R²選自由以下者組成之群組：氫、氟、氯和甲基，
R³選自由以下者組成之群組：氫、氟、氯和甲基，
R⁴選自由以下者組成之群組：氫、甲基、乙基、異丙基和氰基，
R⁵和R⁶獨立地選自由以下者組成之群組：氫、甲基和乙基，
R^{7c}係氫或甲基，並且

Q和Z¹係如對於根據本發明之具有式 (I) 之化合物所定義的。

【0078】 在本發明之另一個實施方式中，具有式 (II) 之化合物可以是具有式 (II-C) 之化合物，其中A係A-4：



其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 Q 和 Z^1 係如對於根據本發明之具有式 (I) 之化合物所定義的。

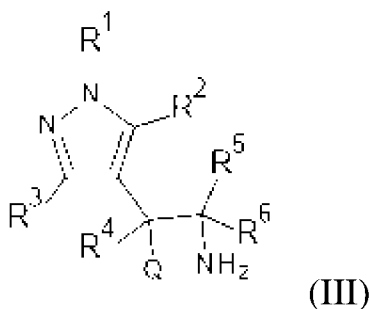
【0079】 在本發明之該實施方式的變體中，具有式 (II) 之化合物可以是具有式 (II-C) 之化合物，其中 Q 係 Q^1 。

【0080】 較佳的是，在本發明之具有式 (II-C) 之化合物中，
 R^1 係 C_1 - C_4 烷基，較佳的是甲基、乙基或異丙基，
 R^2 選自由以下者組成之群組：氫、氟、氯和甲基，
 R^3 選自由以下者組成之群組：氫、氟、氯和甲基，
 R^4 選自由以下者組成之群組：氫、甲基、乙基、異丙基和氰基，
 R^5 和 R^6 獨立地選自由以下者組成之群組：氫、甲基和乙基，並且
 Q 和 Z^1 係如對於根據本發明之具有式 (I) 之化合物所定義的。

【0081】 在根據本發明之具有式 (I)、(II)、(II-A)、(II-B) 和 (II-C) 的化合物的任一者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。

【0082】 更佳的是，根據本發明之具有式 (I) 之化合物選自表C-1至C-23的任一者中或表T1中所列出的化合物。

【0083】 根據本發明之第五方面，提供了一種具有式 (III) 之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) 之化合物者相同的定義。

【0084】 具有式 (III) 之中間體化合物具有與對於根據本發明之具有式 (I) 之化合物和其等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。

【0085】 在根據本發明之具有式 (III) 之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】

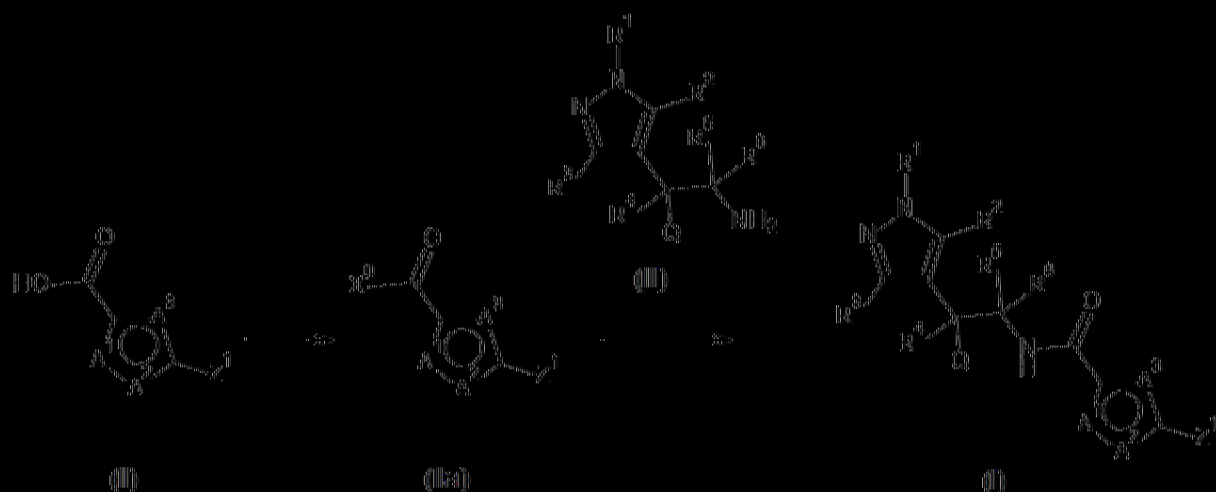
【0086】 無

【實施方式】

【0087】 根據本發明之具有式 (I) 之化合物可以如在以下流程1至10中所示來製備，其中，除非另外說明，否則每一變項的定義係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的。

【0088】 在以下流程1至10的任一者中，在根據本發明之具有式 (I) 之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。

【0089】 如在本發明之任何實施方式中所定義的化合物可以如在以下流



流程2

[(0092)] 羧酸(如具有式 (II) 之化合物)與胺(如具有式 (III) 之化合物)的酯化反應係熟悉該項技術者熟知的，並且描述在例如*Eur. J. Org. Chem.* [歐洲有機化學], 2020, 4641-4651以及其中引用的參考文獻中。

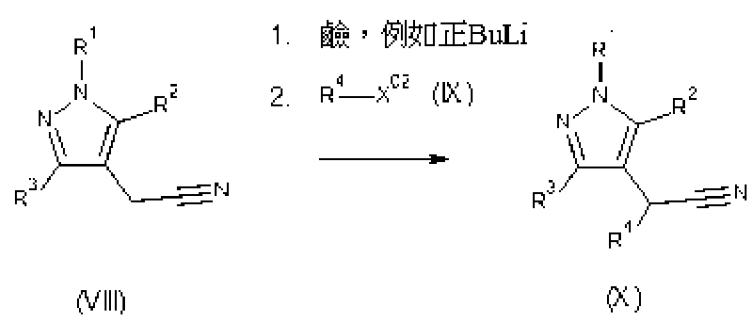
[(0093)] 具有式 (II) 之化合物係可商購的或可以根據或類似於在文獻中描述的程序製備。例如，WO 2018/019929、*Org. Proc. Res. Dev.* [有機過程研究與開發], 2020, 24(2), 228-234、WO 2018/019929、*Lett. Org. Chem.* [有機化學通信], 2010, 1(1), 502-507以及*J. Het Chem.* [雜環化學雜誌], 2015, 52(6), 1823-1833。

[(0094)] 具有式 (III) 之化合物或其鹽(其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 和 Q 係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的)可以由熟悉該項技術者藉由具有式 (IV) 之醇(其中 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 和 Q 係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的)與合適的親核體(如(2-巰基乙基)二氯硼(BMS))在合適的非質子溶劑(如四氫呋喃)中的反應來製備，例如如*The Journal of Organic Chemistry* [有機化學雜誌] 1981 47, 3153中所描述的。可替代地，格氏試劑 R^5MgBr 或 R^6MgBr (其中 R^5 和 R^6 係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的)可以作為親核體依次地或同時地添加至具有式 (IV) 之化合物中，以允許製備更高度取代的具有式 (III) 之胺。在路易斯酸(如 $Et(O^iPr)_4$)的存在下，在惰性溶劑(如乙醚、三級丁基甲氧基醚和環戊基甲氧基醚)中進行此類向醇的格氏加成(參見*Synlett* [合成快報]

係I、Turbo格任亞試劑)中。

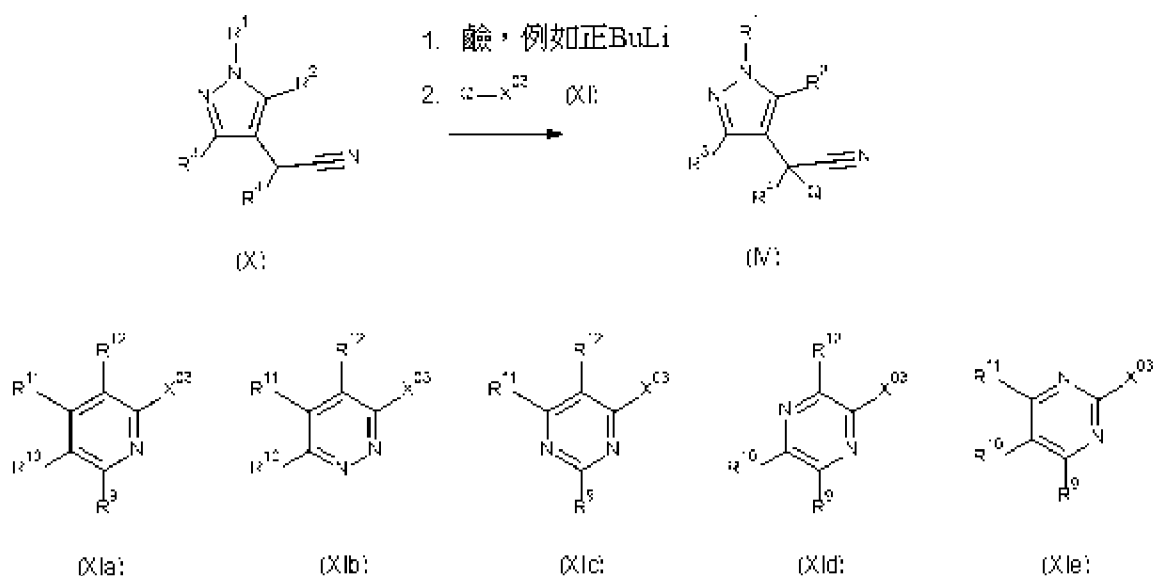
【0099】 具有式 (VI) 和 (VII) 之化合物係可商購的或者容易藉由熟悉該項技術者已知之方法來製備。

【0100】 具有式 (I) 之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) 之化合物 (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) 之化合物。此反應示於流程6中。



流程6

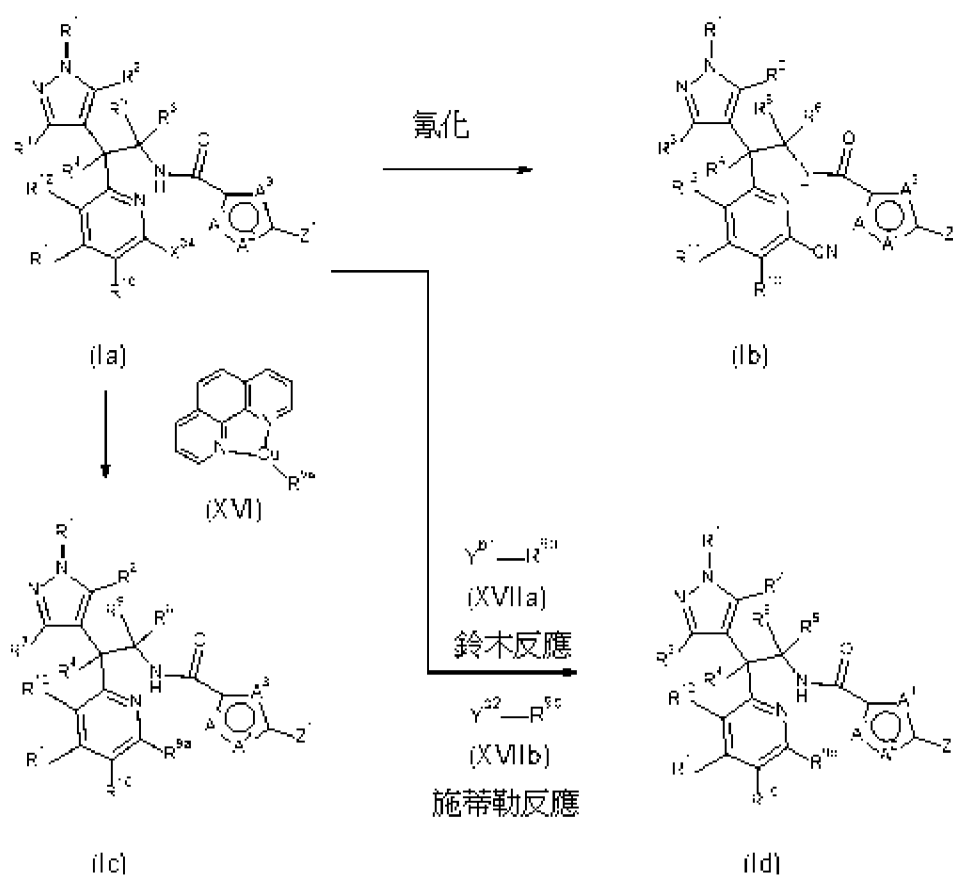
【0101】 然後在惰性溶劑 (如四氫呋喃或三級丁基甲基醚) 中, 在-78°C至室溫之間的溫度下, 用強鹼 (如氫化鈉或烷基鋰鹼如正丁基鋰) 處理具有式 (X) 之化合物 (其中 R^1 、 R^2 、 R^3 和 R^4 係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的), 隨後添加具有式 (XI) 之化合物, 分別是具有式 (XIa)、(XIb)、(XIc)、(XIId) 或 (XIe) 之化合物中的任一種 (其中 R^9 、 R^{10} 、 R^{11} 和 R^{12} 係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的, 並且 X^{03} 係脫離基如鹵素, 較佳的是F、Cl或Br), 得到具有式 (IV) 之化合物。此反應示於流程7中。



流程7

【0102】 如先前在流程1、2和3中所描述的，將具有式 (IV) 之化合物轉化為具有式 (I) 之化合物。熟悉該項技術者將認識到，化合物 (VIII) 轉化為具有式 (IV) 之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) 之化合物能夠精簡轉化為具有式 (IV) 之化合物。這在製備實施例中進行了更詳細的描述。

【0103】 具有式 (Ia) 之化合物 (其中R¹、R²、R³、R⁵、Q、A¹、A²、A³和Z¹係如以上對於具有式 (I) 之化合物所述之，並且R⁴和R⁶係氫)也可以如下製備：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) 之化合物 (其中R⁵係如以上對於具有式 (I) 之化合物所述之) 處理具有式 (VI) 之化合物，分別是具有式 (VIa)、(VIb)、(VIc)、(VId) 或 (Vie) 之化合物中的任一種，得到具有式 (XIII) 之化合物。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) 之化合物。此反應示於流程8中。



流程11

【0109】 如流程11中所示，具有式 (I) 之化合物（其中Q係Q¹，並且R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R¹⁰、R¹¹、R¹²、A¹、A²、A³和Z¹係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的，並且R⁹係氰基，即具有式 (Ib) 之化合物）可以藉由在惰性溶劑（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）處理具有式 (Ia) 之化合物而獲得。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. [利比希化學紀事]*, (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。

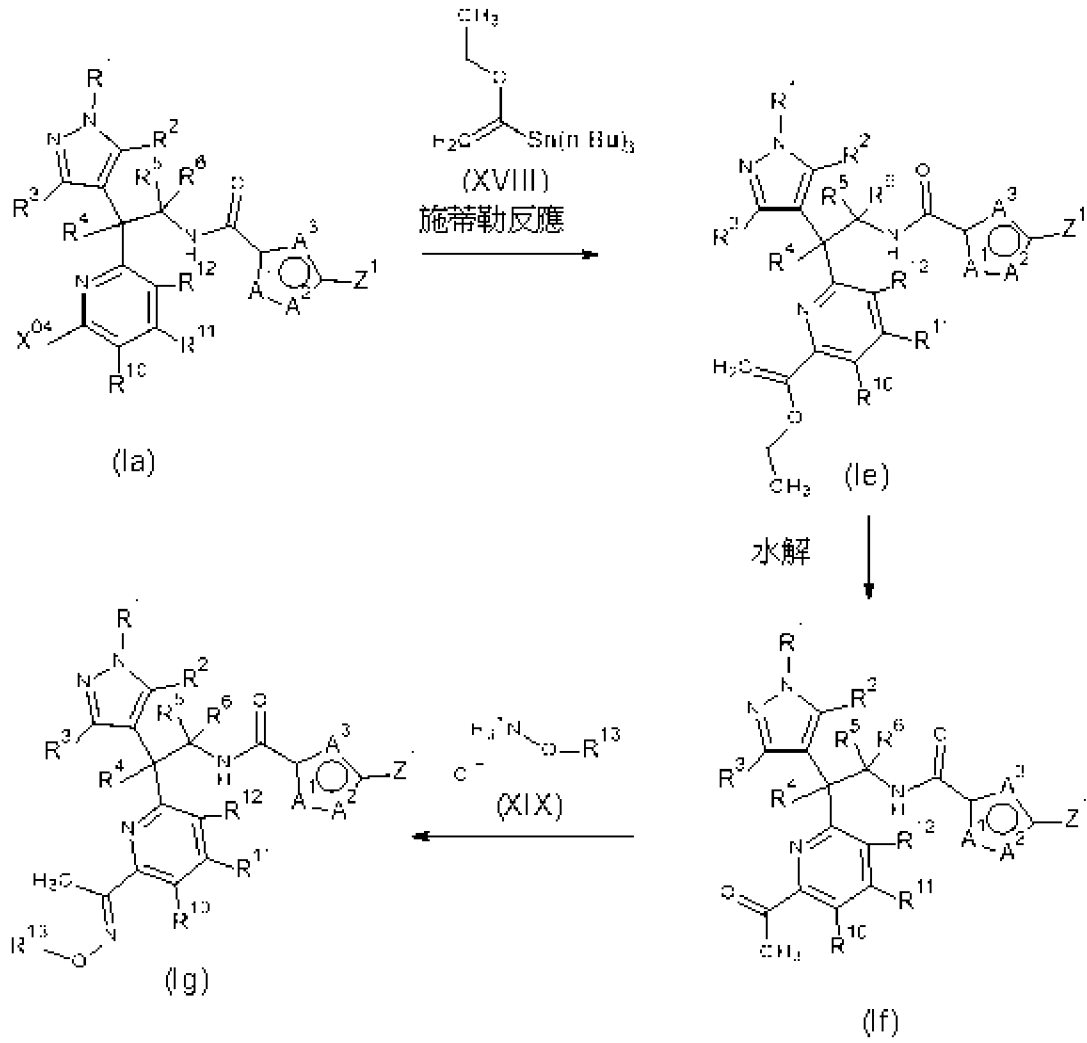
【0110】 具有式 (I) 之化合物（其中Q係Q¹，並且R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R¹⁰、R¹¹、R¹²、A¹、A²、A³和Z¹係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的，

並且 R^{9a} 係 C_1 - C_4 鹵代烷基，即具有式 (Ic) 之化合物) 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 (XVI) 之化合物 (其中 R^{9a} 係 C_1 - C_4 鹵代烷基) 處理具有式 (Ia) 之化合物 (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) 之化合物所定義的，並且 X^{04} 係鹵素，較佳的是溴) 來製備。此類反應在文獻 (*Org. Lett. [有機化學通訊]*, (2014), 16(6), 1744-1747) 中是已知的。具有式 (I) 之化合物 (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) 之化合物所定義的，並且 R^{9b} 係苯基、5 員或 6 員雜芳基或 C_3 - C_6 環烷基，其中該 5 員或 6 員雜芳基包含 1、2、3 或 4 個單獨選自 N、O 和 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 環烷基中的任一者視需要被 1、2 或 3 個獨立地選自鹵素、氰基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵代烷基和 C_1 - C_4 烷氧基的取代基取代，即具有式 (Id) 之化合物) 可以藉由鈴木反應製備 (如流程 11 所示)，該反應包括例如使具有式 (Ia) 之化合物 (其中 X^{04} 係脫離基，像例如氯、溴或碘) 與具有式 (XVIIa) 之化合物 (其中 Y_{b1} 可以是硼衍生的官能基，如例如 $B(OH)_2$ 或 $B(OR_{b1})_2$ ，其中 R_{b1} 可以是 C_1 - C_4 烷基或者兩個基團 OR_{b1} 可以與硼原子一起形成五員環，如例如醌 (pinacol) 硼酸酯) 反應。該反應藉由基於鈀的催化劑 (例如四(三苯基膦)-鈀或 (1,1'-雙(二苯基膦基)-二茂鐵) 二氯化鈀-二氯甲烷 (1:1 錯合物))，在鹼 (像碳酸鈉或氟化銫) 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、或二噁喃和水、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]*, 576, 1999, 147-168 中。

【0111】 可替代地，具有式 (Ic) 之化合物可以藉由具有式 (XVIIb) 之化合物 (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) 之化合

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)二氯鈀-二氯甲烷 (1:1複合物)）的存在下、在惰性溶劑（如DMF、乙腈、或二噁咁）中、視需要在添加劑（如氟化銫或氯化鋰）的存在下、並且視需要在另外的催化劑例如碘化銅 (I) 之存在下進行。此類施蒂勒偶合也是熟悉該項技術者眾所周知的，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 (XVIIa) 和 (XVIIb) 之化合物係可商購的或可以由熟悉該項技術者製備。

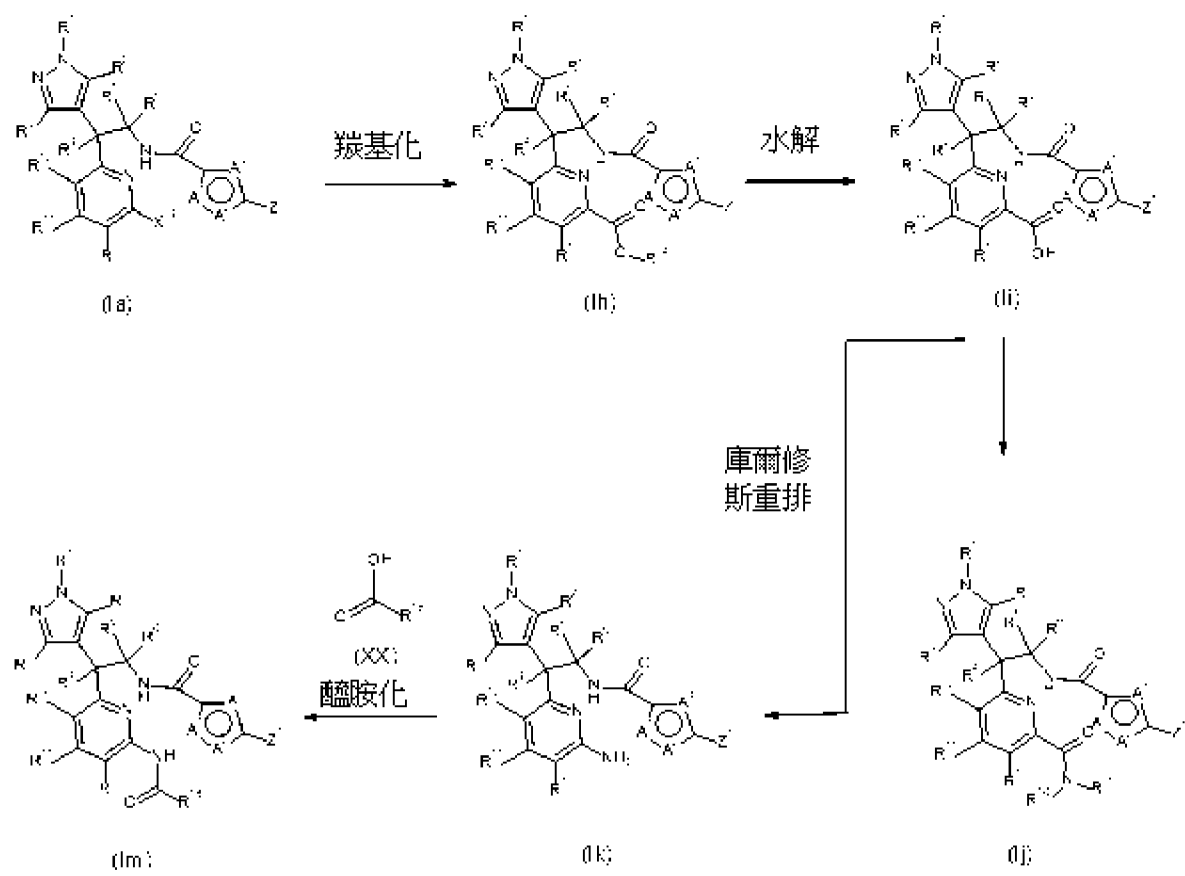
【0112】 由具有式 (Ia) 之化合物可獲得的另外的化合物示於流程12中。



流程12

【0113】 如流程12中所示，具有式 (I) 之化合物（其中Q係Q¹，並且R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R¹⁰、R¹¹、R¹²、A¹、A²、A³和Z¹係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的，並且X⁰⁴係脫離基像例如氯、溴或碘，即具有式 (Ia) 之化合物）可以在施蒂勒反應條件下用具有式 (XVIII) 之化合物處理得到具有式 (Ie) 之化合物。具有式 (Ie) 之化合物可以被分離，或在含水酸性條件下直接水解，得到具有式 (If) 之化合物。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 (XIX) 之化合物（或其鹽）（其中R¹³係氫或C₁-C₄烷基）處理具有式 (If) 之化合物，可以將具有式 (If) 之化合物轉化為具有式 (Ig) 之化合物（其中Q係Q¹，並且R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R¹⁰、R¹¹、R¹²、A¹、A²、A³和Z¹係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的，並且R¹³係氫或C₁-C₄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。

【0114】 另外的化合物可以由具有式 (I) 之化合物（其中Q係Q¹，並且R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R¹⁰、R¹¹、R¹²、A¹、A²、A³和Z¹係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的，並且X⁰⁴係脫離基像例如氯、溴或碘，即具有式 (Ia) 之化合物）來製備，示於流程13中。



流程13

【0115】 如流程13中所示，具有式 (Ia) 之化合物可以被羰基化得到具有式 (I) 之化合物（其中Q係Q¹，並且R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R¹⁰、R¹¹、R¹²、A¹、A²、A³和Z¹係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的，並且R¹⁴係C₁-C₄烷基，即具有式 (Ih) 之化合物）。在此類烷氧基羰基化中，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)Cl₂；雙(三苯基膦基)二氯化鈀(II)PdCl₂(PPh₃)₂或雙(二苯基膦基)丙烷]鈀(II) PdCl₂(dippf)）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）存在下，在醇R¹⁴OH溶劑（通常在甲醇或乙醇）（其中R¹⁴係C₁-C₄烷基）中，視需要在共溶劑（例如甲苯、二噁咁或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°C與200°C之間，較佳的是在50°C與180°C之間的溫度下，具有式 (Ia) 之化合物與一氧化碳反應。此類羰基

化反應係熟悉該項技術者熟知的，並且在文獻（參見*J. Org. Chem.* [有機化學期刊] **2008**, 73, 7102-7107和其中引用的參考文獻）中也是熟知的。此類具有式 (Ih) 之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、四氫呋喃或二噁咁中的氫氧化鈉、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) 之化合物。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) 之酯化合物也可以產生具有式 (Ii) 之羧酸化合物。這種O-脫甲基化的反應溫度範圍較佳的是從20°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) 之化合物可以轉化為具有式 (I) 之醯胺，其中Q係Q¹，並且R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R¹⁰、R¹¹、R¹²、A¹、A²、A³和Z¹係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的，並且R¹⁵和R¹⁶獨立地是氫或C₁-C₄烷基，即具有式 (Ij) 之化合物。此類反應通常包括活化羧基，隨後用化合物R¹⁵R¹⁶NH處理或使用偶合劑在用具有式R¹⁵R¹⁶NH的化合物處理後將酸直接轉化為醯胺。該等方法已經在前面的流程1和2中討論過。

【0116】 具有式 (Ij) 之化合物可以藉由所謂的庫爾修斯重排轉化為具有式 (I) 之化合物，其中Q係Q¹，並且R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R¹⁰、R¹¹、R¹²、A¹、A²、A³和Z¹係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的，並且R⁹係胺基，即具有式 (Ik) 之化合物。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°C與200°C之間的溫度下，用有機疊氮化物處理具有式 (Ij) 之化合物。有機疊氮化物的實例包括TMSN₃、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Zn(OTf)₂以及其他。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) 之胺。可替代地，該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) 之化合物。此類庫爾修斯反應的實例已報導於例如*Org. Lett. [有機化學通訊]*, **2005**, 7, 4107-4110、*Journal of Medicinal Chemistry [藥物化學雜誌]*, **2006**, 49(12), 3614-3627和*Tetrahedron [四面體]*, **1974**, 30, 2151-2157中。根據上文所述之醯胺化方法，藉由用具有式 (XX) 之化合物處理可以將如此獲得的具有式 (Ik) 之化合物醯胺化為具有式 (Im) 之化合物，其中Q係Q¹，並且R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R¹⁰、R¹¹、R¹²、A¹、A²、A³和Z¹係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的，並且R¹⁸係C₁-C₄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) 之化合物，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R⁹、R¹⁰、R¹¹或R¹²）上，當後面的基團係脫離基如鹵素原子時。

【0117】 藉由以常規方式將如在本發明之任何實施方式中所定義的具有式 (I) 之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換可以將該起始化合物按本身已知之方法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) 之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) 之另外的衍生物。

【0118】 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。

【0119】 具有式 (I) 之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) 之化合物的酸加成鹽係藉由用適合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適合的鹼或用合適的離子交換試劑進行處理來獲得的。

【0120】 具有式 (I) 之化合物的鹽能以常規方式轉化為游離的化合物 (I)、酸加成鹽(例如藉由用適合的鹼性化合物或用適合的離子交換劑試劑進行處理)以及與鹼的鹽(例如藉由用適合的酸或用適合的離子交換劑試劑進行處理)。

【0121】 具有式 (I) 之化合物的鹽能以本身已知的方式轉化為具有式 (I) 之化合物的其他鹽、酸加成鹽，例如轉化成其他酸加成鹽，例如藉由在適合的溶劑中用酸的適合的金屬鹽(如鈉、鋁或銀的鹽，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該反應混合物中沈澱出。

【0122】 取決於程序或反應條件，具有成鹽特性的具有式 (I) 之化合物能以游離形式或鹽的形式獲得。

【0123】 具有式 (I) 之化合物和適當時其互變異構物(在每種情況下呈游離形式或呈鹽形式)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。

【0124】 呈游離形式或呈鹽形式的具有式 (I) 之化合物的非鏡像異構物混合物或外消旋物混合物(其等的獲得可以取決於已選定的起始材料和程序)能夠在該等組分的物理化學差異的基礎上，例如藉由分段結晶、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。

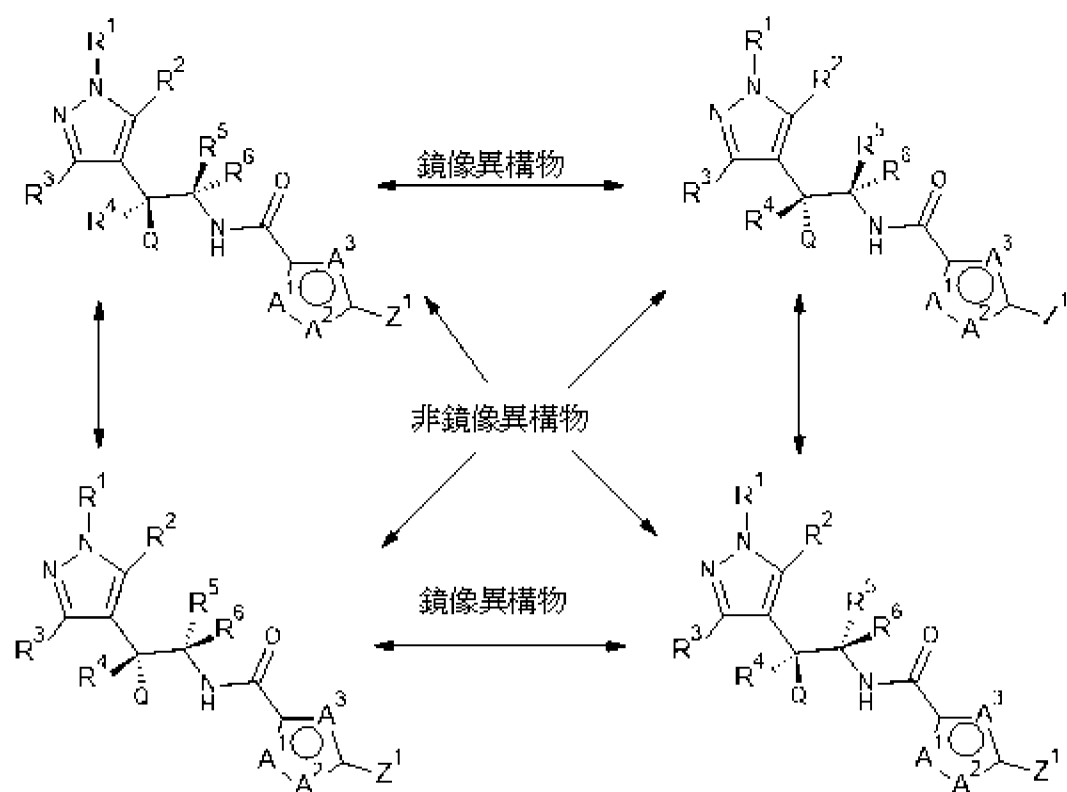
【0125】 能夠以類似方式獲得的鏡像異構物混合物（如外消旋物）可以藉由已知方法拆分成光學對映體，例如藉由從光學活性溶劑再結晶；藉由在手性吸附劑上的層析法，例如在乙醯纖維素上的高效液相層析法（HPLC）；借助於適合的微生物，藉由用特異性固定化酶裂解；藉由形成包容化合物，例如使用手性冠醚，其中僅一個鏡像異構物被錯合；或藉由轉化成非鏡像異構物的鹽，例如藉由使鹼性最終產物外消旋物與光學活性酸（如羧酸，例如樟腦酸、酒石酸或蘋果酸，或磺酸，例如樟腦磺酸）反應，並且分離能夠以此方式獲得的非鏡像異構物混合物，例如基於其不同溶解度藉由分段結晶，從而獲得非鏡像異構物，從該非鏡像異構物可以藉由適合的試劑（例如鹼性試劑）的作用使所希望的鏡像異構物變成游離的。

【0126】 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立體選擇性或對掌體選擇性合成之方法，例如藉由用具有適合的立體化學的起始材料進行根據本發明的方法。

【0127】 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。

【0128】 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。

【0129】 本發明之具有式 (I) 之化合物展現出兩個不對稱碳原子。具有式 (I) 之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。



【0130】 熟悉該項技術者很好地意識到上述具有式 (I) 之非鏡像異構物和鏡像異構物 (其中R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰、R¹¹、R¹²、A¹、A²、A³、Q和Z¹係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的)在本發明之範圍內。

【0131】 具有式 (I) 之化合物和適當時其互變異構物(在每種情況下呈游離形式或呈鹽形式)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者。

【0132】 如已指示的，出人意料地，現在已經發現，為實際目的，本發明之具有式 (I) 之化合物具有非常有利水平的用來保護植物免受由真菌引起的疾病的生物活性。

【0133】 根據本發明之具有式 (I) 之化合物可以在農業領域和相關使用領域中使用，例如用作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率下具有優異的活性，植物耐受良好以及對環境安全。其等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株。具有式 (I)

之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植物部分免於例如植物病原性微生物的侵害。

【0134】 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) 之化合物施用於該植物、其部分或其場所。

【0135】 還能夠使用根據本發明之具有式 (I) 之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如此化合物或如此化合物的組合的量。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感染。

【0136】 還可能使用根據本發明之具有式 (I) 之化合物作為拌種劑以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，用於保護對抗真菌感染連同對抗土壤裡存在的植物病原性真菌。可以在種植前用包含具有式 (I) 之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其等，將具有式 (I) 之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播種溝。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。

【0137】 此外，根據本發明之具有式 (I) 之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。

【0138】 此外，本發明可以用於保護非生命材料（例如木料、牆板和塗料）

免受真菌侵襲。

【0139】 根據本發明之具有式 (I) 之化合物例如對於疾病的真菌和真菌病媒以及植物病原性細菌和病毒係有效的。該等疾病的真菌和真菌病媒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、麴黴屬物種（包括黃麴黴、煙麴黴、構巢麴黴、黑麴黴、土麴黴）、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*））、*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、*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、*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*、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。

【0140】 根據本發明之具有式 (I) 之化合物可以用於例如草坪、觀賞植物，例如花卉、灌木、闊葉樹木或常綠植物，如松柏類、以及用於樹木注入、有害生物管理等。

【0141】 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（canola））、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（bentgrass）、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（bean）、小扁豆（lentil）、豌豆以及大豆；堅果，例如扁桃、腰果、落花生、榛子、花生、美國山核桃、開心果以及核桃；棕櫚植物，例如油棕櫚；觀賞植物，例如花、灌木以及樹；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。

【0142】 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

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。

【0143】術語「有用植物」應當理解為還包括已經藉由使用重組DNA技術轉形以使其能夠合成一種或多種選擇性作用毒素的有用植物,該等毒素係如已知的,例如來自於產毒素細菌,尤其是芽孢桿菌屬者。

【0144】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銨膦銨鹽耐受性的酶膦絲菌素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);VIPCOT*(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*。

【0145】術語「作物」應當理解為還包括已經藉由使用重組DNA技術轉形以使其能夠合成一種或多種選擇性作用毒素的作物植物,該等毒素係如已知的,例如來自於產毒素細菌,尤其是芽孢桿菌屬者。

【0146】可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

δ -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、蛛形綱動物毒素、黃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（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（patatin）、胱抑素（cystatin）、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（luffin）、皂草毒素蛋白（saporin）或異株瀉根毒蛋白（bryodin）；類固醇代謝酶，如3 β -羥基類固醇氧化酶、蛻皮類固醇-UDP-糖基-轉移酶、膽固醇氧化酶、蛻皮酮抑制劑、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、芪合酶、聯苳合酶、幾丁質酶和葡聚糖酶。

【0147】 進一步，在本發明背景下， δ -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。混合型毒素係藉由該等蛋白的不同結構域的新組合重組產生的（參見例如，WO 2002/15701）。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置換。在此類胺基酸置換中，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，一種組織蛋白酶-G-識別序列被插入Cry3A毒素中（參見WO 2003/018810）。

【0148】 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 1993/07278、WO 1995/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878以及WO 2003/052073中。

【0149】 用於製備這樣的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出版物中。CryI型去氧核糖核酸及其製備例如從WO 1995/34656、EP-A-0 367 474、EP-A-0 401 979和WO 1990/13651中已知。

【0150】 包括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）、雙翅昆蟲（雙翅目）和蝴蝶（鱗翅目）。

【0151】 包含一種或多種編碼殺昆蟲抗性的基因並且表現一種或多種毒素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*。

【0152】 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 del'Hobit）27，F-31 790 聖蘇維爾（St. Sauveur），法國，登記號C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉蜀黍，藉由轉基因表現截短的Cry1Ab毒素，使之能抵抗歐洲玉米螟（European corn borer）（歐洲玉米螟（*Ostrinia nubilalis*）和粉莖螟（*Sesamia*

nonagrioides)) 的侵襲。Bt11玉米還轉基因表現PAT酶以獲得對除草劑草銨膦銨鹽的耐受性。

2. Bt176玉米，來自先正達種子公司 (Syngenta Seeds SAS)，霍比特路 (Chemin del'Hobit) 27，F-31 790 聖蘇維爾 (St. Sauveur)，法國，登記號C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉蜀黍，藉由轉基因表現Cry1Ab毒素，使之能抵抗歐洲玉米螟 (European corn borer)(歐洲玉米螟 (*Ostrinia nubilalis*) 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膦銨鹽的耐受性。

3. MIR604玉米，來自先正達種子公司 (Syngenta Seeds SAS)，霍比特路 (Chemin del'Hobit) 27，F-31 790 聖蘇維爾 (St. Sauveur)，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膦銨鹽的耐受性。

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。

【0153】 根據本發明之具有式 (I) 之化合物可用於控制或預防植物病原性疾病，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。

【0154】 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。其包括土壤、種子以及幼苗、以及建立的植被。

【0155】 術語「植物」係指植物的所有有形部分，包括種子、幼苗、幼樹、根、塊莖、莖、葉柄花梗、葉子和果實。

【0156】 術語「植物繁殖材料」應理解為表示植物的生殖部分，如種子（其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。

【0157】 根據本發明之具有式 (I) 之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使用的輔助劑一起使用。為此目的，其等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、可直接噴霧的或可稀

釋的溶液或懸浮液、稀釋乳液、可濕性粉劑、可溶性粉劑、塵劑、顆粒、以及封裝物，例如在聚合物的物質中。對於該等組成物的類型，根據預期的目的以及所處環境來選擇施用方法，例如噴灑、霧化、撒粉、播散、包衣或傾倒。組成物還可以含有另外的輔助劑，如穩定劑、消泡劑、黏度調節劑、黏合劑或增黏劑、以及肥料、微量營養素供體或其他用於獲得特殊效果的配製物。

【0158】 合適的載體以及輔助劑，例如對於農業用途，可以是固體或液體的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、黏合劑或肥料類。此類載體例如描述在 WO 1997/33890 中。

【0159】 懸浮液濃縮物係活性化合物的細末固體顆粒懸浮於其中的水性配製物。此類配製物包括抗沉降劑和分散劑，並且可以進一步包括濕潤劑以增強活性、以及消泡劑和晶體生長抑制劑。在使用時，將該等濃縮物稀釋在水中，並且通常以噴霧劑的形式施用至有待處理的區域。活性成分的量的範圍可以是從 0.5% 至 95% 的該濃縮物。

【0160】 可濕性粉劑係呈在水中或其他液態載體中容易分散的細末顆粒形式。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% 到 95% 的活性成分加上少量的濕潤劑、分散劑或乳化劑。

【0161】 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、異佛爾酮和其他不揮發有機溶劑。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 0.5% 至 95% 的該濃縮物。

【0162】 顆粒配製物包括擠出物和較粗顆粒兩者，並且通常不用稀釋地施

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、厄帖浦石黏土、膨潤土、蒙脫石黏土、蛭石、珍珠岩、碳酸鈣、磚、浮石、葉蠟石、高嶺土、白雲石、灰泥、木粉、玉米穗軸磨粉、花生殼磨粉、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、氧化銻、冰晶石、石膏、矽藻土（diatomaceous earth）、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、膠或合成樹脂。

【0163】 塵粉劑係活性成分與細末固體（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。

【0164】 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。包囊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括溶劑。包囊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、厄帖浦石黏土、鋸屑和碳粒。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。

【0165】 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活性成分以細末形式分散。

【0166】 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

業輔助劑和載體係熟悉該項技術者熟知的。

【0167】 可以利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、二乙二醇、松香酸二乙二醇酯、二乙二醇丁醚、二乙二醇乙醚、二乙二醇甲醚、N,N-二甲基甲醯胺、二甲亞砷、1,4-二噁吡、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、碳酸乙烯酯、1,1,1-三氯乙烷、2-庚酮、 α -蒎烯、d-蒎烯、乙二醇、乙二醇丁醚、乙二醇甲醚、 γ -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 (isobornyl) 酯、異辛烷、異佛爾酮、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、三乙二醇、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劑。

【0168】 合適的固體載體包括例如滑石、二氧化鈦、葉臘石黏土、矽石、厄帖浦石黏土、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。

【0169】 在所述液體和固體組成物兩者 (尤其是被設計為可在施用前用載體稀釋者) 中可有利地採用廣泛的表面活性劑。該等試劑在使用時通常按重量計

組成配製物的從0.1%到15%。其等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，如壬基苯酚-C18乙氧基化物；醇-環氧烷加成產物，如十三烷醇-C16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。

【0170】 通常在農業組成物中使用的其他輔助劑包括結晶抑制劑、黏度調節劑、懸浮劑、噴霧微滴調節劑、顏料、抗氧化劑、發泡劑、防泡劑、遮光劑、增容劑、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。

【0171】 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順序地施用。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。

【0172】 本文提及的使用其通用名的殺有害生物劑係，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。

【0173】 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號US 6,919,298中，並且包括例如水楊酸鹽以及商售的SAR誘導劑阿拉酸式苯-S-

甲基。

【0174】 根據本發明之具有式 (I) 之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順序地施用至作物區域或有待處理的植物。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。其等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若干種的混合物，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輔助劑一起。

【0175】 根據本發明之具有式 (I) 之化合物可以以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，該組成物包含作為活性成分的至少一種具有式 (I) 之化合物或至少一種如本文所定義的較佳個別化合物（呈游離形式或呈農用化學上可用的鹽形式）和至少一種上述輔助劑。

【0176】 因此，本發明提供了包含至少一種根據本發明之具有式 (I) 之化合物、農業上可接受的載體和視需要輔助劑的組成物，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，除了包含具有式 (I) 之化合物，所述組成物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。

【0177】 根據本發明之具有式 (I) 之化合物可以是組成物的唯一活性成分，或者適當時其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無法預期的協同活性。

【0178】 合適的另外的活性成分的實例包括以下者：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、味啉殺真菌劑、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、喹呋啉殺真菌劑、嗜毬果傘素殺真菌劑、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、三吡殺真菌劑、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。

【0179】 合適的另外的活性成分的實例包括以下者：石油、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、涕滅砒威、賽果、果滿磷、胺吸磷、草酸氫胺吸磷、雙甲脒、殺蟎特、三氧化二砷、偶氮苯、偶氮磷、苯菌靈、苯諾沙磷（benoxafos）、苯甲酸苄酯、聯苯吡菌胺、溴滅菊酯、溴烯殺、溴硫磷、溴蟎酯、噻吡酮、丁酮威、丁酮砒威、丁基噻蟎靈、多硫化鈣、八氯蒽烯、氯滅殺威、三硫磷、蟎蜱胺、滅蟎猛、殺蟎醚、殺蟲脒、殺蟲脒鹽酸鹽、殺蟎醇、殺蟎酯、敵蟎特、乙酯殺蟎醇、滅蟎脒（chloromebuform）、滅蟲脒、丙酯殺蟎醇、蟲蟎磷、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、磺吸磷（demeton-S-methylsulfon）、抑菌靈、敵敵畏、二氯磷（dicliphos）、除蟎靈、甲氟磷、消蟎酚（dinex）、消蟎酚（dinex-diclexine）、

敵蟎普-4、敵蟎普-6、鄰敵蟎消、硝戊酯、硝辛酯、硝丁酯、敵殺磷、磺基二苯、戒酒硫、DNOC、苯氧炔蟎 (dofenapyn)、朵拉克汀、因毒磷、依立諾克丁、益硫磷、乙嘧硫磷、抗蟎唑、苯丁錫、苯硫威、必蟎立克 (fenpyrad)、唑蟎酯、胺苯吡菌酮、除蟎酯、氟硝二苯胺 (fentrifanil)、氟蟎噻、氟蟎脲、聯氟蟎、氟殺蟎、FMC 1137、伐蟲脒、伐蟲脒鹽酸鹽、胺甲威 (formparanate)、 γ -HCH、果綠定、苧蟎醚、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、丙蟎氰、滅蚜磷、二噻磷、甲硫芬、蟲蟎畏、溴甲烷、速滅威、自克威、米爾貝肟、丙胺氟、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、氟蟎靈、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、苧氯菊酯、芬硫磷、伏殺磷、硫環磷、磷胺、氯化松節油 (polychloroterpenes)、殺蟎素 (polynactins)、丙氯諾、蜚虱威、殘殺威、乙噻唑磷、發疏磷、除蟲菊酯I、除蟲菊酯II、除蟲菊酯、嗒吡硫磷、嘧硫磷、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、氟蟎吡、 τ -氟胺氰菊酯、TEPP、叔丁威、四氯殺蟎砒、殺蟎好、噻酚諾 (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、環丙沙星 (cybutryne)、二氯萘醌、雙氯酚、菌多酸、三苯錫、熟石灰、代森鈉、滅藻醌、醌苳胺、西瑪津、三苯基乙酸錫、三苯基氫氧化錫、育畜磷、吡啶、托布津、氯醛糖、倍硫磷、吡啶-4-胺、土的寧、1-羥基-1H-吡啶-2-硫酮、4-(喹啉-2-基胺基)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 (*Amblyseius* spp.)、芹菜夜蛾NPV、原櫻翅縷小蜂 (*Anagrus atomus*)、短距蚜小蜂 (*Aphelinus abdominalis*)、棉蚜寄生蜂 (*Aphidius colemani*)、食蚜癭蚊 (*Aphidoletes aphidimyza*)、苜蓿銀紋夜蛾NPV、球形芽孢桿菌 (*Bacillus sphaericus* Neide)、布氏白僵菌 (*Beauveria brongniartii*)、普通草蛉 (*Chrysoperla carnea*)、孟氏隱唇瓢蟲 (*Cryptolaemus montrouzieri*)、蘋果蠹蛾GV、西伯利亞離顎繭蜂 (*Dacnusa sibirica*)、豌豆潛葉蠅姬小蜂 (*Diglyphus isaea*)、麗蚜小蜂 (*Encarsia formosa*)、槲角蚜小蜂 (*Eretmocerus eremicus*)、嗜菌異小桿線蟲 (*Heterorhabditis bacteriophora*) 和大異小桿線蟲 (*H. megidis*)、斑長足瓢蟲 (*Hippodamia convergens*)、橘粉介殼蟲寄生蜂 (*Leptomastix dactylopii*)、盲蝽 (*Macrolophus caliginosus*)、甘藍夜蛾NPV、黃闊柄跳小蜂 (*Metaphycus helvolus*)、黃綠綠僵菌 (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*)、金龜子綠僵菌小孢變種 (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*)、歐洲新松葉蜂 (*Neodiprion sertifer*) NPV和紅頭新松葉蜂 (*N. lecontei*) NPV、小花蝽屬物種、玫煙色擬青黴 (*Paecilomyces fumosoroseus*)、智利小植綫蟎 (*Phytoseiulus persimilis*)、毛蚊線蟲 (*Steinernema bibionis*)、小卷蛾斯氏線蟲 (*Steinernema carpocapsae*)、夜蛾斯氏線蟲、格氏線蟲 (*Steinernema glaseri*)、銳比斯氏線蟲 (*Steinernema riobrave*)、*Steinernema riobrave*、螻蛄斯氏線蟲 (*Steinernema scapterisci*)、斯氏線蟲屬物種 (*Steinernema* spp.)、赤眼蜂屬物種、西方盲走蟎 (*Typhlodromus occidentalis*)、蠟蚧輪枝菌 (*Verticillium lecanii*)、啞磷吡 (*apholate*)、雙(氮丙啶)甲胺基磷硫化物 (*bisazir*)、白消安、迪麥替夫 (*dimatif*)、六甲蜜胺 (*hemel*)、六甲磷 (*hempa*)、甲基涕巴 (*metepa*)、甲硫涕巴 (*methiotepa*)、甲基啞磷吡 (*methyl apholate*)、不孕啶 (*morzid*)、氟幼脲 (*penfluron*)、涕巴 (*tepa*)、硫代六甲磷 (*thiohempa*)、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、 α -多紋素、西部松小蠹集合資訊素、十二碳二烯醇(codlure)、可得蒙(codlemone)、誘蠅酮(cuelure)、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(frontalin)、誘殺烯混劑(grandlure)、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(hexalure)、齒小蠹二烯醇(ipsdienol)、小蠹烯醇(ipsenol)、金龜子性誘劑(japonilure)、三甲基二氧三環壬烷(lineatin)、利特魯爾(litlure)、粉紋夜蛾性誘劑(looplure)、誘殺酯(medlure)、巨甲酸(megatomoic acid)、誘蟲醚(methyl eugenol)、誘蟲烯(muscalure)、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(orfralure)、椰蛀犀金龜聚集資訊素(oryctalure)、非樂康(ostramone)、誘蟲環(siglure)、索爾丁(sordidin)、食菌甲誘醇(sulcatol)、十四碳-11-烯-1-基乙酸酯、地中海實蠅引誘劑(trimedlure)、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、庚二烯酸酯(trunc-call)、2-(辛基硫代)乙醇、避蚊酮(butopyronoxyl)、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(dimethyl carbate)、鄰苯二甲酸二甲酯、乙基己二醇、己脲(hexamide)、甲嗪丁(methoquin-butyl)、甲基新癸醯胺(methylneodecanamide)、草醯胺酸酯(oxamate)、派卡瑞丁(picaridin)、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、 α -蛻皮酮、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 δ -內毒素、六氟
矽酸鋁、多硫化鋁、熏菊酯、拜耳22/190、拜耳22408、 β -氟氯氰菊酯、 β -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、氯肼肟磷、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 (diamidafos)、異氯磷、除線磷、敵來死 (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、
蛻皮固酮、EI 1642、EMPC、EPBP、依他伏殺 (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、氧嘧噻胺
(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、苧蟎醚 (halfenprox)、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、啉蟲磷、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、威百畝、威百畝鉀鹽、威百畝鈉鹽、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、硝蟲噻吡、原菸鹼、O-5-二氯-4-碘代苯基 O-乙基乙基硫代膦酸酯、O,O-二乙基 O-4-甲基-2-側氧基-2H-苯并呋喃-7-基硫代膦酸酯、O,O-二乙基 O-6-甲基-2-丙基嘧啶-4-基硫代膦酸酯、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、噻胺嘧啶磷、丙氟菊酯、猛殺威、丙硫磷、吡菌磷、反滅蟲菊、苦木萃取物 (quassia)、噻硫磷-甲基、畜寧磷、碘柳胺、苧呋菊脂、魚藤酮、噻噁菊酯、魚尼汀、利阿諾定、沙巴藜蘆 (sabadilla)、八甲磷、克線丹、SI-0009、噻丙腈、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、噻蟎威、TDE、丁基嘧啶磷、雙硫磷、環戊烯丙菊酯、四氯乙烷、噻氯磷、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、啉蚜威、異皮蠅磷-3 (trichlormetaphos-3)、毒壤磷、混殺威、三氟甲氧威 (tolprocarb)、氯啉菌酯、烯蟲硫酯、藜蘆定、藜蘆鹼、XMC、澤他米林 (zetamethrin)、磷化鋅、啉蟲磷、氯氟醚菊酯、四氟醚菊酯、雙(三丁基錫)氧化物、溴乙噻胺、磷酸鐵、氯硝柳胺-乙醇胺、三丁基氧化錫、吡味啉、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-硫代-1,3,5-噻二吡-3-基乙酸、6-異戊烯基胺基嘌呤、茴香苷、苯氯噻 (benclothiaz)、細胞分裂素、DCIP、糠醛、異噻胺磷 (isamidofos)、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 (*Reynoutria sachalinensis*) 萃取物、 α -氯代醇、安妥、碳酸鋇、雙鼠脲、溴鼠隆、溴敵隆、溴鼠胺、氯鼠酮、膽鈣化醇、氯殺鼠靈、克滅鼠、殺鼠茶、殺鼠啞啉、鼠得克、噻鼠靈、敵鼠、鈣化醇、氟鼠靈、氟乙噻胺、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、硫酸鉍、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、增效醚 (piperonyl butoxide)、增效醛、增效酯 (propyl isomer)、S421、增效散、芝麻林素 (sesamol)、亞砷、蔥醌、環烷酸銅、王銅、二環戊二烯、塞命、環烷酸鋅、福美鋅、衣馬寧、利巴韋林、氯吡啶噻肼、氧化汞、甲基托布津、阿紫康唑、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、抑癭唑、噻胺唑、種菌唑、葉菌唑、腈菌唑、多效唑、稻瘟酯、戊菌唑、丙硫菌唑、啞斑肱、咪鮮胺、丙環唑、啞菌惡唑、矽氟唑、戊唑醇、氟醚唑、三唑酮、三唑醇、氟菌唑、滅菌唑、啞啉醇、氯苯啞啉醇、氟苯啞啉醇、乙啞啉磺酸酯 (bupirimate)、甲菌定 (dimethirimol)、乙菌定 (ethirimol)、十二環咪啉、苯鏽啉 (fenpropidin)、丁苯咪啉、螺環菌胺、十三咪啉、啞菌環胺、啞菌胺、啞菌胺 (pyrimethanil)、拌種咯、咯菌腈、苯霜靈 (benalaxyl)、呋霜靈 (furalaxyl)、甲霜靈、R-甲霜靈、呋噻胺、惡霜靈 (oxadixyl)、多菌靈、咪菌威 (debacarb)、麥穗寧、噻苯達唑、乙菌利 (chlorzoxazole)、菌核利 (dichlozoline)、甲菌利 (myclozoline)、腐菌利 (procymidone)、乙烯菌核利 (vinclozoline)、啞噻菌胺 (boscalid)、萎鏽靈、甲

呋喃胺、氟呋喃胺 (flutolanil)、滅鏽胺、氧化萎鏽靈、吡噻菌胺 (penthioopyrad)、
 噻呋喃胺、多果定、雙胍辛胺、嘧菌酯、醚菌胺、烯肟菌酯、烯肟菌胺、氟菌蟎
 酯、氟嘧菌酯、醚菌酯、苯氧菌胺、肟菌酯、肟醚菌胺、啉氧菌酯、啉菌胺酯、
 啉胺菌酯、啉菌酯、福美鐵、代森錳鋅、代森錳、代森聯、甲代森鋅 (propineb)、
 代森鋅、敵菌丹 (captafol)、克菌丹、啉啉草 (fluoroimide)、滅菌丹、對甲抑菌
 靈、波爾多 (bordeaux) 混合物、氧化銅 (copper oxide)、代森錳銅 (mancopper)、
 啉啉銅 (oxine-copper)、酞菌酯 (nitrothal-isopropyl)、克瘟散、異稻瘟淨
 (iprobenphos)、氯瘟磷 (phosdiphen)、甲基立枯磷 (tolclofos-methyl)、敵菌靈、
 苯噻菌胺、滅瘟素 (blasticidin)-S、地茂散 (chloroneb)、百菌清、環氟菌胺、
 霜脲氰、環丁氟菌胺、雙氯氰菌胺 (diclocymet)、噻菌酮 (diclomezine)、氯硝
 胺 (dicloran)、乙臘威 (diethofencarb)、烯肟味啉、氟味啉、二噻農 (dithianon)、
 噻啉菌胺 (ethaboxam)、土菌靈 (etridiazole)、惡啉菌酮、咪啉菌酮 (fenamidone)、
 稻瘟呋喃胺 (fenoxanil)、嘧菌脞 (ferimzone)、氟啉胺 (fluazinam)、flumetysulfurim、
 氟吡菌胺 (fluopicolide)、fluoxytioconazole、磺菌胺 (flusulfamide)、氟啉菌呋喃胺、
 環呋喃菌胺、三乙膦酸鋁 (fosetylaluminium)、惡臘靈 (hymexazol)、丙森鋅、賽
 座滅 (cyazofamid)、磺菌威 (methasulfocarb)、苯菌酮、戊菌隆 (pencycuron)、
 苯酞、多氧臘素 (polyoxins)、霜臘威 (propamocarb)、吡菌苯威、啉啉啉酮
 (proquinazid)、咯啉酮 (pyroquilon)、苯啉菌酮 (pyriofenone)、啉氧靈、五氯
 硝基苯、噻呋喃菌胺、咪啉啉 (triazoxide)、三環啉、啉胺靈、有效臘素、嘧菌胺、
 苯呋喃菌胺 (zoxamide)、雙炔呋喃菌胺 (mandipropamid)、氟苯醚呋喃胺、吡啉萘菌胺
 (isopyrazam)、氟啉環菌胺 (sedaxane)、苯并烯氟菌啉、氟啉菌呋喃胺、3-二氟
 甲基-1-甲基-1H-吡啉-4-甲酸(3',4',5'-三氟-聯苯-2-基)-呋喃胺、異氟環丙胺、異噻菌
 胺、二吡米曲尼 (dipymetitrone)、6-乙基-5,7-二側氧基-吡咯并[4,5][1,4]二噻英
 (thiino)并[1,2-c]異噻啉-3-甲腈、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-噻吩-3-甲腈、(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、氟茚啉菌胺、甲香菌酯 (jiaxiangjunzhi)、利本米昔安、二氯苯噻唑、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、聯苯吡啉菌胺 (pyraziflumid)、氟蟲胺 (inpyrfluxam)、胺基甲酸酯類殺菌劑 (trolprocarb)、氯氟醚菌唑、一苯三氟康唑 (ipfentrifluconazole)、2-(二氟甲基)-N-[(3R)-3-乙基-1,1-二甲基-二氫茚-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)吡啶-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] 甲磺酸鹽、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)噻吩、吡啶甲醯氯 (pyridachlometyl)、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、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、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、胺基吡芬 (aminopyrifin)、啞啞菌胺、吡啶磺菌胺、氟啞菌胺、(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、吡啶菌醯胺、苯吡克咪德 (fenpicoxamid)、甲基吡蟲胺、異丁乙氧喹啉、伊氟芬喹、奎富馬林、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]吡啶-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-噁吡啶-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-噁吡啶-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-噁吡啶-4-甲醯胺（可以由WO 2020/109391中描述之方法製備）、N-[2-[2,4-二氯-苯氧基]苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-吡唑-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-吡唑-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、氟噻唑菌腈、氟醚菌醯胺、吡丙炔、吡啶啉（picarbutrazox）、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、2-(二氟甲基)-N-((3R)-1,1,3-三甲基二氫茚-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]苯甲腈、甲基四脯胺酸、2-(二氟甲基)-N-((3R)-1,1,3-三甲基二氫茚-4-基)吡啶-3-甲醯胺、 α -(1,1-二甲基乙基)- α -[4'-(三氟甲氧基)[1,1'-二苯基]-4-基]-5-嘧啶甲醇、氟沙普羅林、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-異丙基吡唑-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-丙基吡唑-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)吡唑-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]苯甲腈、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]苯甲腈、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(5-硫代-4H-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲腈、抗倒酯、丁香菌酯、中生菌素、噻菌銅、噻唑
鋅、阿米托林、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]異噁唑烷-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]異噁唑烷-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-二氫茚-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）。

【0180】 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-357460、EP-444964以及EP-594291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US-5015630、WO-9415944以及WO-9522552中所述者。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）。

【0181】 本發明之化合物可以與對郝喹醯胺/馬可氟汀類驅蠕蟲藥劑的衍生物及類似物以及抗寄生蟲噁唑啉（如US-5478855、US-4639771和DE-19520936中所揭露者）組合使用。

【0182】 本發明之化合物可以與如WO-9615121中所述之一般種類二側氧基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縮酚肽（如WO-9611945、WO-9319053、WO-9325543、EP-626375、EP-382173、WO-9419334、EP-382173、以及EP-503538中所述者）組合使用。

【0183】 本發明之化合物可以與其他殺外寄生蟲藥組合使用；例如，氟蟲腈；擬除蟲菊酯；有機磷酸酯；昆蟲生長調節劑如氯芬奴隆；蛻皮酮促效劑如蟲

醯肼等；新菸鹼類如吡蟲啉等。

【0184】 本發明之化合物可以與萆烯生物鹼類組合使用，例如WO 95/19363或WO 04/72086中所述者，特別是其中所揭露的化合物。

【0185】 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者：

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-甲基磷、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、異吡啶磷、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、proetamphos、丙硫磷、吡啶硫磷、嗒吡硫磷、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。

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、茚蟲威、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。

擬除蟲菊酯：氟丙菊酯、丙烯除蟲菊酯、順式氯氰菊酯 (alphenetrin)、5-苄基-3-呋喃基甲基(E)-(1R)-順式-2,2-二甲基-3-(2-側氧基硫雜環戊-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。

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、噻吡
 酮、苯蟲醚、噻蟬酮、乙蟬唑、四蟬吡 (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：螺蟬酯。

其他抗寄生蟲藥：滅蟬醯、雙甲脒、AKD-1022、ANS-118、印楝素、蘇雲金桿
 菌、殺蟲磺、聯苯肼酯、樂殺蟬、溴蟬酯、BTG-504、BTG-505、毒殺芬、殺螟
 丹、敵蟬酯、殺蟲脒、溴蟲腈、環蟲醯肼、噻蟲胺、賽滅淨、敵克隆登 (diaclofen)、
 殺蟬隆、DBI-3204、二活菌素、二羥基甲基二羥基吡咯啉、敵蟬通、敵蟬普、硫
 丹、乙蟲腈、醚菊酯、啞蟬醚、氟蟬吡 (flumite)、MTI-800、啞蟬酯、啞蟬酯、
 氟蟬噻、溴氟菊酯、氟蟬吡、三氟醚、苄蟬醚 (fluproxyfen)、苄蟬醚 (halofenprox)、
 氟蟬脒、IKI-220、水矽鈉石、NC-196、印度薄荷草 (neem guard)、尼敵諾特呋
 喃 (nidinortofuran)、烯啶蟲胺、SD-35651、WL-108477、啞蟲丙醚、克蟬特、
 普羅芬布特 (protrifenbute)、吡蚜酮、噻蟬酮、啞蟬醚、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、吡蟬胺、三氯殺蟬磺、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。

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 δ 內毒素、桿狀病毒、昆蟲病原細菌、病毒以及真菌。

殺細菌劑：金黴素、土黴素、鏈黴素。

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、頭孢噻呋、卡洛芬、美氟脞、吡喹酮、三氯苯達唑。

【0186】 具有式 (I) 之化合物與活性成分的以下混合物係較佳的。縮寫「TX」意指選自由如在表C1-C23或(下)表T1中所示的化合物組成之群組中的一種化合物：

選自由以下組成的物質組的化合物：石油 + 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、乙醯蟲脒 + TX、涕滅威 + TX、賽果 + TX、果蟎磷 + TX、胺吸磷 + TX、胺吸磷殺蟲環 + TX、雙甲脒 + 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、噻吡酮 + TX、丁酮威 + TX、丁酮砒威 + TX、丁基噻蟎靈 + TX、多硫化鈣 + TX、毒殺芬 + TX、氯滅殺威 + TX、三硫磷 + TX、蟎蜱胺 + TX、滅蟎猛 + TX、氯殺蟎 + TX、殺蟲脒 + TX、殺蟲脒鹽酸鹽 + TX、殺蟎醇 + TX、殺蟎酯 + TX、敵蟎丹 + TX、乙酯殺蟎醇 + TX、伊托明 (*chloromebuform*) + TX、滅蟲脒 + 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、氯氰碘柳胺 + TX、蠅毒磷 + TX、克羅米通 + TX、丁烯磷 + 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、磺吸磷 (demeton-S-methylsulfon) + TX、抑菌靈 + TX、敵敵畏 + TX、二氯磷 + TX、除蟎靈 + TX、甲氟磷 + TX、消蟎酚 (dinx) + TX、消蟎酚 (dinx-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、必蟎立克 + 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、伐蟲脒 + TX、伐蟲脒鹽酸鹽 + TX、胺甲威 (formparanate) + TX、 γ -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、米爾貝肟 + 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、蟬虱威 + 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、嗒吡硫磷 + TX、噻硫磷 + 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、 τ -氟胺氰菊酯 + TX、TEPP + TX、叔丁威 + TX、四氯殺蟎虱 + TX、殺蟎好 + TX、噻酚諾 + 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、環丙沙星 + 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、醌苳胺 + TX、西瑪津 + TX、三苯基乙酸錫 + TX、三苯基氫氧化錫 + TX、育畜磷 + TX、哌吡 + 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 (Amblyseius spp.) + TX、芹菜夜蛾NPV + TX、原櫻翅縷小蜂 (Anagrus atomus) + TX、短距蚜小蜂 (Aphelinus abdominalis) + TX、棉蚜寄生蜂 (Aphidius colemani) + TX、食蚜瘿蚊 (Aphidoletes aphidimyza) + TX、苜蓿銀紋夜蛾NPV + TX、球形芽孢桿菌 (Bacillus sphaericus Neide) + TX、布氏白僵菌 (Beauveria brongniartii) + TX、普通草蛉 (Chrysoperla carnea) + TX、孟氏隱唇瓢蟲 (Cryptolaemus montrouzieri) + TX、蘋果蠹蛾GV + TX、西伯利亞離顎繭蜂 (Dacnusa sibirica) + TX、豌豆潛

葉蠅姬小蜂 (*Diglyphus isaea*) + TX、麗蚜小蜂 (*Encarsia formosa*) + TX、槲角
 蚜小蜂 (*Eretmocerus eremicus*) + TX、嗜菌異小桿線蟲 (*Heterorhabditis*
bacteriophora) 和大異小桿線蟲 (*H. megidis*) + TX、斑長足瓢蟲 (*Hippodamia*
convergens) + TX、橘粉介殼蟲寄生蜂 (*Leptomastix dactylopii*) + TX、盲蝽
 (*Macrolophus caliginosus*) + TX、甘藍夜蛾NPV+ TX、黃闊柄跳小蜂(*Metaphycus*
helvolus) + TX、黃綠綠僵菌 (*Metarhizium anisopliae* var. *acridum*) + TX、金龜
 子綠僵菌小孢變種 (*Metarhizium anisopliae* var. *anisopliae*) + TX、歐洲新松葉蜂
 (*Neodiprion sertifer*) NPV和紅頭新松葉蜂 (*N. lecontei*) NPV + TX、小花蝽屬
 物種 + TX、玫煙色擬青黴 (*Paecilomyces fumosoroseus*) + TX、智利小植綫蟎
 (*Phytoseiulus persimilis*) + TX、毛蚊線蟲 (*Steinernema bibionis*) + TX、小卷蛾
 斯氏線蟲 (*Steinernema carpocapsae*) + TX、夜蛾斯氏線蟲 + TX、格氏線蟲
 (*Steinernema glaseri*) + TX、銳比斯氏線蟲 (*Steinernema riobrave*) + TX、
Steinernema riobrave + TX、蠟蜱斯氏線蟲 (*Steinernema scapterisci*) + TX、斯
 氏線蟲屬物種 (*Steinernema* spp.) + TX、赤眼蜂屬物種 + TX、西方盲走蟎
 (*Typhlodromus occidentalis*) + TX、蠟蚧輪枝菌 (*Verticillium lecanii*) + TX、啞
 磷吡 (*apholate*) + TX、雙(氮丙啶)甲胺基磷硫化物 (*bisazir*) + TX、白消安 +
 TX、迪麥替夫 (*dimatif*) + TX、六甲蜜胺 (*hemel*) + TX、六甲磷 (*hempa*) +
 TX、甲基涕巴 (*metepa*) + TX、甲硫涕巴 (*methiotepa*) + TX、甲基啞磷吡 (*methyl*
apholate) + TX、不孕啶 (*morzid*) + TX、氟幼脲 (*penfluron*) + TX、涕巴 (*tepa*)
 + TX、硫代六甲磷 (*thiohempa*) + 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、
 α -多紋素 + TX、西部松小蠹集合資訊素 + TX、十二碳二烯醇(codlure)+ TX、
 可得蒙(codlemone)+ TX、誘蠅酮(cuelure)+ 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(frontalin)+ TX、誘殺烯混劑(grandlure)+ 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(hexalure)+ TX、齒小蠹二烯醇(ipsdienol)+ TX、小蠹烯醇(ipsenol)
 + TX、金龜子性誘劑(japonilure)+ TX、三甲基二氧三環壬烷(lineatin)+ TX、
 利特魯爾 + TX、粉紋夜蛾性誘劑(looplure)+ TX、誘殺酯(medlure)+ TX、
 巨甲酸 + TX、誘蟲醚(methyl eugenol)+ TX、誘蟲烯(muscalure)+ 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
 (orfralure)+ TX、椰蛀犀金龜聚集資訊素(oryctalure)+ TX、非樂康(ostramone)
 + TX、誘蟲環(siglure)+ TX、索爾丁 + TX、食菌甲誘醇(sulcatol)+ TX、十
 四碳-11-烯-1-基乙酸酯 + TX、地中海實蠅引誘劑(trimedlure)+ 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、庚二烯酸酯 + TX、2-(辛基硫代)乙醇 + TX、避蚊酮
 (butopyronoxyl)+ 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(dimethyl carbate)
 + TX、鄰苯二甲酸二甲酯 + TX、乙基己二醇 + TX、己脲(hexamide)+ TX、
 甲嗪丁(methoquin-butyl)+ TX、甲基新癸醯胺(methylneodecanamide)+ TX、

草醯胺酸酯 (oxamate) + TX、派卡瑞丁 (picaridin) + 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-異戊醯二氫茚-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-苯基吡唑-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、α-蛻皮酮 + 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δ-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、β-氟氯氰菊酯 + TX、β-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、特噞硫磷 (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、氯膦肟磷 + TX、氯吡唑磷 (chlorprazophos) + TX、順式苄呋菊酯 (cis-resmethrin) + TX、順式苄呋菊酯 (cismethrin) + TX、氰菊酯 (clocythrins) (別名) + TX、乙醯亞砷酸銅 + TX、砷酸銅 + TX、油酸銅 + TX、畜蟲磷 (coumithoate) + 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 (diamidafos) + TX、異氯磷 + TX、除線磷 + TX、dicresyl + TX、
 環蟲腈 + TX、狄氏劑 + TX、二乙基5-甲基吡唑-3-基磷酸酯 + TX、喘定 (dior)
 + TX、四氟甲醚菊酯 + TX、地麥威 + TX、苄菊酯 + 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、蛻皮固酮 + TX、EI 1642 + TX、EMPC
 + TX、EPBP + TX、etaphos + 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、氧嘧噻胺 (fenoxacrim) + TX、吡氯氰菊酯 + TX、豐索
 磷 + TX、乙基倍硫磷 + TX、氟氯雙苯隆 (flucofuron) + 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、苄蟊醚 (halfenprox) + 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、啉蟲磷 + 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
 基磺噻氟 + 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、硝蟲噻吡 + TX、原菸鹼 + TX、O-5-二氯-4-碘代苯基 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-苯并呋喃-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、噠胺嘧啶磷 + 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、噠硫磷-甲基 + TX、畜寧磷 + TX、碘柳胺 + TX、苧呋菊脂 + TX、魚藤酮 + TX、噠噠菊酯 + 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、噠丙腈 + 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、磺苯醚隆 (sulcofuron) + TX、磺苯醚隆鈉鹽 (sulcofuron-sodium) + TX、硫噠氟 + TX、硫丙磷 + TX、焦油 + TX、噠蟎威 + 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、噠氯磷 + 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、啞蚱威 + 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、澤他米林 + 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、溴乙噠胺 + TX、磷酸鐵 + TX、氯硝柳胺-乙醇胺 + TX、三丁基氧化錫 + TX、吡味啉 + 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 + TX、5-甲基-6-硫代-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、苯氯噠 (benclothiaz) + TX、

細胞分裂素 + TX、DCIP + TX、糠醛 + TX、異噻胺磷 (isamidofos) + 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 (Reynoutria sachalinensis) 萃取物 + TX、 α -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、氟乙噻胺 + 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、硫酸鉈 + 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、增效醚 + TX、增效醛 + TX、增效酯 (propyl isomer) + TX、S421 + TX、增效散 + TX、芝麻林素 (sesasmolin) + TX、亞碲 + 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、氟喹唑 + 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、啞斑肱 (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、乙嘧酚磺酸酯 (bupirimate) + TX、甲菌定 (dimethirimol) +

TX、乙菌定 (ethirimol) + TX、十二環咪啉 + TX、苯鏽啉 (fenpropidin) + TX、
 丁苯咪啉 + TX、螺環菌胺 + TX、十三咪啉 + TX、嘧菌環胺 + TX、嘧菌胺 +
 TX、嘧菌胺 (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、腐菌利 (procymidone) + TX、乙烯菌核利 (vinclozoline)
 + TX、啞醯菌胺 (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
 肱菌酯 (enestroburin) + TX、烯肱菌胺 + TX、氟菌蟎酯 + TX、氟嘧菌酯 +
 TX、醚菌酯 + TX、苯氧菌胺 + TX、肱菌酯 + TX、肱醚菌胺 + TX、啞氧菌酯
 + 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、啞呋草 + 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、噻啉銅 + 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、環丁氟菌胺 + TX、雙氯氰菌胺
 (diclocymet) + TX、噻菌酮 (diclomezine) + TX、氯硝胺 (dicloran) + TX、
 乙肱威 (diethofencarb) + TX、烯醯咪啉 + TX、氟咪啉 + 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、嘧菌腈 (ferimzone)
 + TX、氟啞胺 (fluazinam) + TX、氟吡菌胺 (fluopicolide) + TX、磺菌胺

(flusulfamide) + TX、氟唑菌酯胺 + TX、環酯菌胺 + TX、三乙膦酸鋁 (fosetylaluminium) + 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、碘啶唑酮 (proquinazid) + TX、咯啶酮 (pyroquilon) + TX、苯啉菌酮 (pyriofenone) + TX、啶氧靈 + TX、五氯硝基苯 + TX、噻酯菌胺 + TX、咪唑吡 (triazoxide) + TX、三環唑 + TX、吡啶靈 + TX、有效黴素 + TX、顯菌胺 + TX、苯酯菌胺 (zoxamide) + TX、雙炔酯菌胺 (mandipropamid) + TX、氟苯醚酯胺 + TX、吡啶萘菌胺 (isopyrazam) + TX、氟唑環菌胺 (sedaxane) + TX、苯并烯氟菌唑 + TX、氟唑菌酯羧胺 + TX、3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡啶-4-甲酸(3',4',5'-三氟-聯苯-2-基)-酯胺 + TX、異氟環丙胺 + TX、異噻菌胺 + TX、二吡米曲尼 (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-甲脒 + TX、2-(二氟甲基)-N-[3-乙基-1,1-二甲基-二氫茚-4-基]吡啶-3-甲酯胺 + TX、4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基-噻吡-3-甲脒 + TX、(R)-3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[1,1,3-三甲基二氫茚-4-基]吡啶-4-甲酯胺 + 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、氟茚唑菌胺 + TX、甲香菌酯 (jiaxiangjunzhi) + TX、利本米昔安 (lvbenmixianan) + TX、二氯苯噻唑 (dichlobentiazox) + TX、曼德斯賓 (mandestrobin) + TX、3-(4,4-二氟-3,4-二氫-3,3-二甲基異喹啉-1-基)喹啉酮 + TX、2-[2-氟-6-[(8-氟-2-甲基-3-喹啉基)氧基]苯基]丙-2-醇 + TX、噻吡菌靈 (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、聯苯吡啶菌胺 (pyraziflumid) + TX、氟蟲胺 (inpyrfluxam) + TX、胺基甲酸酯類殺菌劑 (trolprocarb) + TX、氯氟醚菌唑 + TX、一苯三氟康唑 (ipfentrifluconazole)

+ 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] 甲磺酸鹽 + 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)嗒啡 + TX、吡啶甲醯氯 (pyridachlometyl) + TX、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 + TX、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 + TX、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 + TX、胺基吡芬 (aminopyrifen) + TX、唑啞菌胺 + TX、引唑磺菌胺 + TX、氟唑菌苯胺 + TX、(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 + TX、吡啶菌醯胺 + TX、苯吡克咪德 (fenpicoxamid) + TX、異丁乙氧喹啉 + TX、伊氟芬喹 (ipflufenquin) + TX、奎富馬林 (quinofumelin) + 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-吡唑-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-吡唑-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、吡丙炔 (pyrpropoxine) + 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、甲基四脯胺酸 (metyltetraprole) + 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、 α -(1,1-二甲基乙

基)- α -[4'-(三氟甲氧基)[1,1'-聯苯基]-4-基]-5-嘧啶甲醇 + TX、氟沙普羅林 (fluoxapiprolin) + TX、烯肱菌酯 (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]苯甲腈 + 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]苯甲腈 + TX、4-[[6-[2-(2,4-二氟苯基)-1,1-二氟-2-羥基-3-(5-硫代-4H-1,2,4-三唑-1-基)丙基]-3-吡啶基]氧基]苯甲腈 + TX、抗倒酯 + TX、丁香菌酯 + TX、中生菌素 + TX、噻菌銅 + TX、噻唑鋅 + TX、阿米托林 (amectotractin) + 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 (此種化合物可以由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-(6,7-二甲基吡唑并[1,5-a]吡啶-3-基)-4,4,5-三氟-3,3-二甲基-異喹啉 + TX、1-(6,7-二甲基吡唑并[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-甲基吡唑并[1,5-a]吡啶-3-基)異喹啉 + TX、4,4-二氟-3,3-二甲基-1-(7-甲基吡唑并[1,5-a]吡啶-3-基)異喹啉 + TX、1-(6-氯-7-甲基-吡唑并[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]異噁唑烷-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]異噁唑烷-3-酮 + TX、1-[[4-[5-(三氟甲基)-1,2,4-噁二唑-3-基]苯基]甲基]吡唑-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']二吡咯-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)吡唑-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 (flumetysulfurim) + TX、氟康唑 (fluoxystrobin) + TX、氟蟲胺嘧啶 (flufenoxadiazam) + TX、甲基吡蟲胺 (metarylpicoxamid) + TX。

【0187】 在活性成分之後的括弧中的參考號例如[3878-19-1]係指化學文摘登記號。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，其等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「阿巴美丁」以條目編號 (1) 來描述。在「[CCN]」在上文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，其可以在網際網路 [A. Wood；Compendium of Pesticide Common Names，Copyright © 1995-2004] 上獲得；例如，化合物「乙醯蟲脞」描述於網際網路位

址<http://www.alanwood.net/pesticides/acetoprole.html>。

【0188】 上述活性成分中的大多數藉由上文中所謂的「通用名」來表示，在個別情形中使用相應的「ISO通用名」或其他「通用名」。若名稱不是「通用名」，則所替代使用的名稱類別在特定化合物的圓括號中給出；在該情況下，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」，或若既不使用該等名稱之一也不使用「通用名」，則使用「別名」。「CAS登記號」意指化學文摘登記號。

【0189】 選自如如表C1至C-23或(下)表T1中所示的一種化合物的具有式(I)之化合物的活性成分混合物的混合比率較佳的是從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，還更佳的是從2:1至1:2。該等混合比率係按重量計的。

【0190】 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。

【0191】 包含如表C-1至C-23或(下)表T1中所示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」的形式施用，以組合的噴霧混合物(其由單一活性成分組分的個別配製物構成)(如「桶混製劑」)施用，以及當以順序方式(即，一個接著另一個地，在適度短時期內，如幾小時或幾天)施用時組合使用單一活性成分施用。施用如表C-1至C-23或(下)表T1中所示的化合物和一種或多種如上所述之活性成分的順序對於實施本發明並不是至關重要的。

【0192】 根據本發明之組成物還可以包含其他固體或液體輔助劑，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。

【0193】 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、篩分和/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。

【0194】 本發明之另一方面關於根據本發明之具有式 (I) 之化合物的或如本文所定義的較佳個別化合物的、包含至少一種具有式 (I) 之化合物或至少一種如本文所定義的較佳個別化合物的組成物的、或包含至少一種具有式 (I) 之化合物或至少一種如本文所定義的較佳個別化合物（與如以上所描述的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。

【0195】 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) 之化合物或如本文所定義的較佳個別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。

【0196】 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）的侵染減少至被證明改進的水平。

【0197】 包括施用根據本發明之具有式 (I) 之化合物或含有至少一種具

有式 (I) 之化合物的農用化學組成物的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。施用頻率和施用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) 之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呈固體形式的化合物例如以顆粒形式施用到土壤（土壤施用）而經由土壤通過根（內吸作用）滲透植物。在稻作物中，可以將此類顆粒施用到灌水的稻田中。具有式 (I) 之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，或藉由用固體配製物對其等進行包衣而施用到種子（包衣）。

【0198】 配製物（例如含有根據本發明之具有式 (I) 之化合物、以及（如果需要）固體或液體輔助劑或用於封裝具有式 (I) 之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。

【0199】 有利的施用率通常是從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，最較佳的是從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。

【0200】 當本發明之組合用於處理種子時，0.001至50 g 具有式 (I) 之化合物/kg種子，較佳的是從0.01至10 g/kg種子的比率通常係足夠的。

【0201】 適當地，預防性（意指在疾病進展之前）或治療性（意指在疾病進展之後）施用根據本發明之包含具有式 (I) 之化合物的組成物。

【0202】 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劑（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劑（CF）、種子處理用的凝膠（GF）、乳液濃縮劑（EC）、懸浮液濃縮物（SC）、懸浮乳液（SE）、膠囊懸浮劑（CS）、水分散性粒劑（WG）、

可乳化性粒劑(EG)、油包水型乳液(EO)、水包油型乳液(EW)、微乳液(ME)、分散性油懸劑(OD)、油懸劑(OF)、油溶性液劑(OL)、可溶性濃縮劑(SL)、超低容量懸浮劑(SU)、超低容量液劑(UL)、母藥(TK)、可分散性濃縮劑(DC)、可濕性粉劑(WP)或與農業上可接受的輔助劑組合的任何技術上可行的配製物形式。

【0203】 可以按常規方式製備此類組成物，例如藉由混合活性成分與適當的配製惰性劑(稀釋劑、溶劑、填充劑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效力的常規緩釋配製物。特別地，有待以噴霧形式施用的配製物(如水分散性濃縮物(例如EC、SC、DC、OD、SE、EW、EO等)、可濕性粉劑及顆粒劑)可以含有表面活性劑(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、烷基芳基磺酸鹽、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。

【0204】 使用本發明之組合及稀釋劑，以適合的拌種配製物形式，例如水性懸浮液或具有對種子的良好黏著性的乾粉劑形式，用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。

【0205】 通常，配製物包括按重量計從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輔助劑，該活性劑由至少根據本發明之具有式(I)之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。儘管商售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。

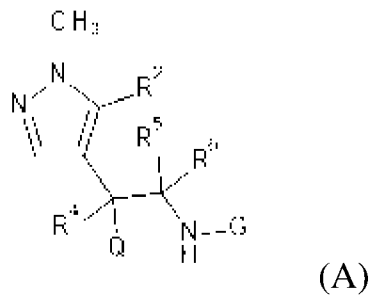
【0206】 儘管較佳的是將商售的產品配製為濃縮物，最終使用者將通常使用稀釋的配製物。

【0207】 本申請案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。

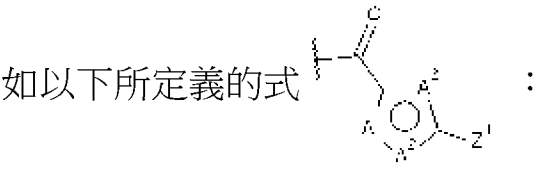
【0208】 根據以下表C-1至C-23的化合物可以根據上述方法製備。隨後的實例旨在說明本發明並且展示較佳的具有式 (I) 之化合物。在以下表C-1至C-23的任一項中，在根據本發明之具有式 (I) 之化合物中一個或多個可能的不對稱碳原子的存在意味著該等化合物能以手性異構物形式存在，即，鏡像異構物或非鏡像異構物的形式。

[表A]

【0209】 此表揭露了12種具有式 (A) 之化合物：



其中R²、R⁴、R⁵、R⁶和Q係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的，並且G係

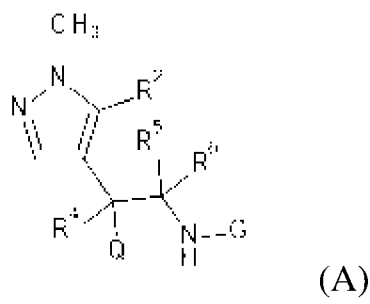


索引	G	索引	G
G1	[5-(2,4-二氟苯基)異呋唑-3-羰基]	G7	[5-(4-氟苯基)異呋唑-3-羰基]
G2	[5-(2,4-二氯苯基)異呋唑-3-羰基]	G8	[5-(4-氯苯基)異呋唑-3-羰基]
G3	[3-(2,4-二氟苯基)異呋唑-5-羰基]	G9	[3-(4-氟苯基)異呋唑-5-羰基]

索引	G	索引	G
	基]		
G4	[3-(2,4-二氯苯基)異噁唑-5-羰基]	G10	[3-(4-氯苯基)異噁唑-5-羰基]
G5	[5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噁二唑-2-羰基]	G11	[5-(4-氟苯基)-1,3,4-噁二唑-2-羰基]
G6	[5-(2,4-二氯苯基)-1,3,4-噁二唑-2-羰基]	G12	[5-(4-氯苯基)-1,3,4-噁二唑-2-羰基]

[表B]

【0210】 此表揭露了33種具有式 (A) 之化合物：

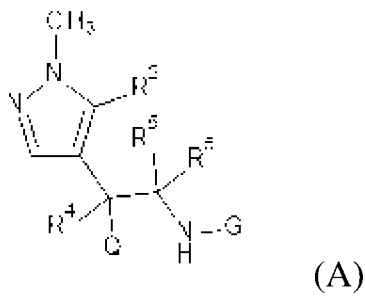


其中R²、R⁴、R⁵、R⁶和G係如以上對於具有式 (I) 之化合物所定義的，並且Q係如以下所定義的：

索引	Q	索引	Q
Q1	2-吡啶基	Q18	[4-(4-氯吡唑-1-基)-2-吡啶基]
Q2	(6-氯-2-吡啶基)	Q19	[4-(4-氯苯基)-2-吡啶基]
Q3	(6-甲氧基-2-吡啶基)	Q20	(6-溴-2-吡啶基)
Q4	(6-甲基磺醯基-2-吡啶基)	Q21	(6-氟-2-吡啶基)
Q5	[6-(三氟甲基)-2-吡啶基]	Q22	(5-氯-2-吡啶基)
Q6	[6-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-2-吡啶基]	Q23	(3-氯-2-吡啶基)
Q7	[6-(2,2,2-三氟乙氧基)-2-吡啶基]	Q24	嗒咩-3-基
Q8	[6-(2,2-二氟乙氧基)-2-吡啶基]	Q25	(6-氯嗒咩-3-基)
Q9	[6-(4-氯吡唑-1-基)-2-吡啶基]	Q26	嘧啶-4-基

索引	Q	索引	Q
Q1 ₀	[6-(4-氯苯基)-2-吡啶基]	Q27	(6-氯嘧啶-4-基)
Q1 ₁	(4-氯-2-吡啶基)	Q28	(2-氯嘧啶-4-基)
Q1 ₂	(4-甲氧基-2-吡啶基)	Q29	(5-氯吡啶-2-基)
Q1 ₃	(4-甲基磺醯基-2-吡啶基)	Q30	(6-氯吡啶-2-基)
Q1 ₄	[4-(三氟甲基)-2-吡啶基]	Q31	吡啶-2-基
Q1 ₅	[4-(1,1,2,2,2-五氟乙基)-2-吡啶基]	Q32	(4-氯嘧啶-2-基)
Q1 ₆	[4-(2,2,2-三氟乙氧基)-2-吡啶基]	Q33	嘧啶-2-基
Q1 ₇	[4-(2,2-二氟乙氧基)-2-吡啶基]		

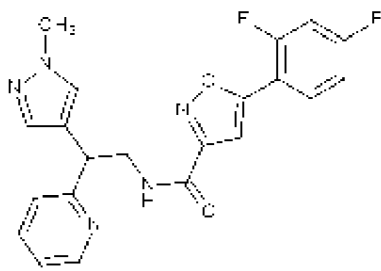
【0211】 表C-1至C-23揭露了特定的具有式 (A) 之化合物：



其中R²、R⁴、R⁵和R⁶係如表C-1至C-23中任一項所定義的，並且G和Q取代基分別是如表A和B中所定義的。

【0212】 表C-1：此表提供了12種具有式 (A) 之化合物C-1.01至C-1.012，其中R²、R⁴、R⁵和R⁶係H，Q係Q1，並且G係如表A中所定義的。

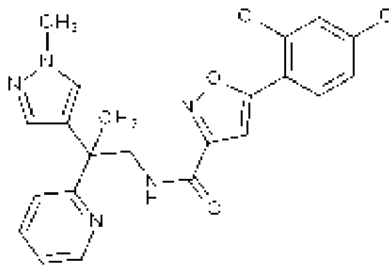
【0213】 例如，化合物C-1.01具有以下結構：



化合物C-1.01

【0214】 表C-2：此表提供了12種具有式 (A) 之化合物C-2.01至C-2.012，其中R²、R⁵和R⁶係H，R⁴係CH₃，Q係Q1，並且G係如表A中所定義的。

【0215】 例如，化合物C-2.02具有以下結構：



化合物C-2.02

【0216】 表C-3：此表提供了12種具有式 (A) 之化合物C-3.01至C-3.012，其中R²、R⁴、R⁵和R⁶係H，Q係Q2，並且G係如表A中所定義的。

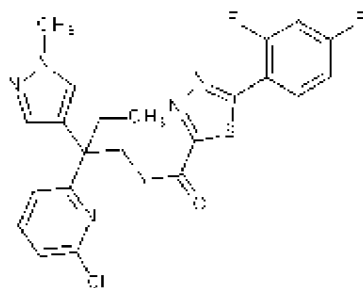
【0217】 表C-4：此表提供了12種具有式 (A) 之化合物C-4.01至C-4.012，其中R²、R⁵和R⁶係H，R⁴係CH₃，Q係Q2，並且G係如表A中所定義的。

【0218】 表C-5：此表提供了12種具有式 (A) 之化合物C-5.01至C-5.012，其中R⁵和R⁶係H，R²和R⁴係CH₃，Q係Q2，並且G係如表A中所定義的。

【0219】 表C-6：此表提供了12種具有式 (A) 之化合物C-6.01至C-6.012，其中R⁵和R⁶係H，R²係氟，R⁴係CH₃，Q係Q2，並且G係如表A中所定義的。

【0220】 表C-7：此表提供了12種具有式 (A) 之化合物C-7.01至C-7.012，其中R²、R⁵和R⁶係H，R⁴係CH₂CH₃，Q係Q2，並且G係如表A中所定義的。

【0221】 例如，化合物C-7.05具有以下結構：



化合物C-7.05

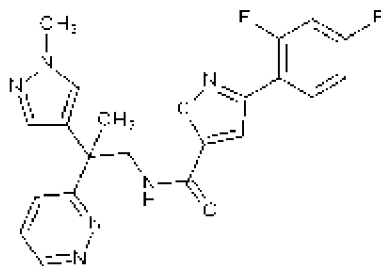
【0222】 表C-8：此表提供了12種具有式 (A) 之化合物C89.01至C-8.012，其中R²、R⁵和R⁶係H，R⁴係CH(CH₃)₂，Q係Q2，並且G係如表A中所定義的。

【0223】 表C-9：此表提供了12種具有式 (A) 之化合物C-9.01至C-9.012，其中R²、R⁵和R⁶係H，R⁴係CN，Q係Q2，並且G係如表A中所定義的。

【0224】 表C-10：此表提供了12種具有式 (A) 之化合物C-10.01至C-10.012，其中R²、R⁵和R⁶係H，R⁴係CH₂OCH₃，Q係Q2，並且G係如表A中所定義的。

【0225】 表C-11：此表提供了6種具有式 (A) 之化合物C-11.01至C-11.06，其中R²、R⁵和R⁶係H，R⁴係CH₃，Q係Q24，並且G係如表A中所定義的。

【0226】 例如，化合物C-11.03具有以下結構：



化合物C-11.03

【0227】 表C-12：此表提供了6種具有式 (A) 之化合物C-12.01至C-12.06，其中R²、R⁵和R⁶係H，R⁴係CH₃，Q係Q25，並且G係如表A中所定義的。

【0228】 表C-13：此表提供了6種具有式 (A) 之化合物C-13.01至C-13.06，其中R²、R⁵和R⁶係H，R⁴係CH₃，Q係Q26，並且G係如表A中所定義的。

【0229】 表C-14：此表提供了6種具有式 (A) 之化合物C-14.01至C-14.06，其中R²、R⁵和R⁶係H，R⁴係CH₃，Q係Q27，並且G係如表A中所定義的。

【0230】 表C-15: 此表提供了6種具有式 (A) 之化合物C-15.01至C-15.06, 其中 R^2 、 R^5 和 R^6 係H, R^4 係 CH_3 , Q係Q28, 並且G係如表A中所定義的。

【0231】 表C-16: 此表提供了6種具有式 (A) 之化合物C-16.01至C-16.06, 其中 R^2 、 R^5 和 R^6 係H, R^4 係 CH_3 , Q係Q29, 並且G係如表A中所定義的。

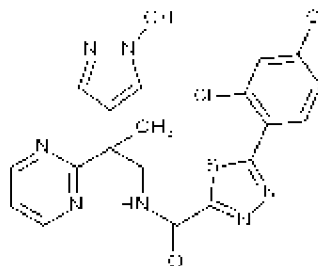
【0232】 表C-17: 此表提供了6種具有式 (A) 之化合物C-17.01至C-17.06, 其中 R^2 、 R^5 和 R^6 係H, R^4 係 CH_3 , Q係Q30, 並且G係如表A中所定義的。

【0233】 表C-18: 此表提供了6種具有式 (A) 之化合物C-18.01至C-18.06, 其中 R^2 、 R^5 和 R^6 係H, R^4 係 CH_3 , Q係Q31, 並且G係如表A中所定義的。

【0234】 表C-19: 此表提供了6種具有式 (A) 之化合物C-19.01至C-19.06, 其中 R^2 、 R^5 和 R^6 係H, R^4 係 CH_3 , Q係Q32, 並且G係如表A中所定義的。

【0235】 表C-20: 此表提供了6種具有式 (A) 之化合物C-20.01至C-20.06, 其中 R^2 、 R^5 和 R^6 係H, R^4 係 CH_3 , Q係Q33, 並且G係如表A中所定義的。

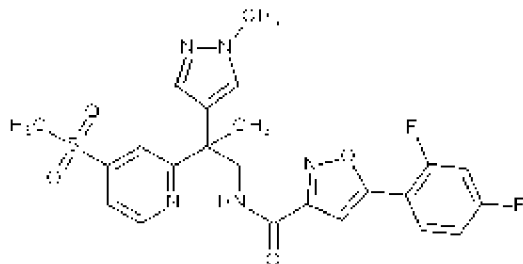
【0236】 例如, 化合物C-20.06具有以下結構:



化合物C-20.06

【0237】 表C-21: 此表提供了31種具有式 (A) 之化合物C-21.03至C-21.033, 其中 R^2 、 R^5 和 R^6 係H, R^4 係 CH_3 , G係G1, 並且Q係如表B中所定義的。

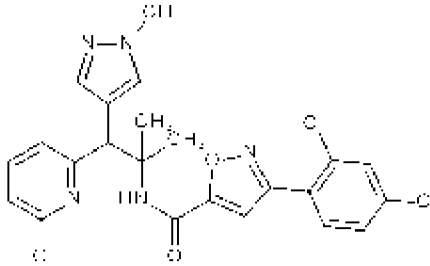
【0238】 例如, 化合物C-21.013具有以下結構:



化合物C-21.013

【0239】 表C-22: 此表提供了6種具有式 (A) 之化合物C-22.01至C-22.06, 其中R²和R⁴係H, R⁵和R⁶係甲基, Q係Q2, 並且G係如表A中所定義的。

【0240】 例如, 化合物C-22.04具有以下結構:



化合物C-22.04

【0241】 表C-23: 此表提供了6種具有式 (A) 之化合物C-23.01至C-23.06, 其中R²、R⁴和R⁵係H, R⁶係甲基, Q係Q2, 並且G係如表A中所定義的。

實施例

【0242】 以下的實施例用於說明本發明, 並且不意味著以任何方式限制本發明。

【0243】 本發明之化合物與已知化合物的區別可以在於在低施用率下更大的效力, 此可以由本領域的普通技術人員使用在實施例中概述的實驗程序(如果必要的話使用更低的施用率, 例如, 60 ppm、20 ppm或2 ppm)來證實。

【0244】 具有式 (I) 之化合物可以具有許多益處, 尤其包括用於保護植物抵抗由真菌引起的疾病的有利水平的生物活性或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、增加的安全特性(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)以及其他。

【0245】 貫穿本說明書, 以攝氏度給出溫度並且「m.p.」意指熔點。LC/MS意指液相層析-質譜, 並且裝置和方法的描述如下。

【0246】 在Brucker 400 MHz光譜儀上記錄¹H NMR測量值, 化學位移相對於TMS標準物以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性LCMS值係保留時間（「Rt」，以分鐘記錄）和測得的分子離子(M+H)⁺或(M-H)⁻。

方法A

【0247】 在以下者上記錄光譜：來自沃特斯公司（Waters Corporation）的質譜儀（SQD、SQDII或QDA單四極桿質譜儀），其裝備有電灑源（極性：正離子和負離子），毛細管：0.8-3.00 kV，錐：5-30 V，源溫度：120°C-150°C，去溶劑化溫度：350°C-600°C，錐氣體流量：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0.2min，在0.05 min內100%-10% B，10% B等度持續0.05 min。

方法B

【0248】 在以下者上記錄光譜：來自沃特斯公司的質譜儀（SQD、SQDII或QDA單四極桿質譜儀），其裝備有電灑源（極性：正離子和負離子），毛細管：0.8-3.00 kV，錐：5-30 V，源溫度：120°C-150°C，去溶劑化溫度：350°C-600°C，錐氣體流量：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：3.0 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2.5 min內10%-100% B，100% B等度持續0.3 min。

方法C

【0249】 在以下者上記錄光譜：來自沃特斯公司的質譜儀（SQD、SQDII或QDA單四極桿質譜儀），其裝備有電灑源（極性：正離子和負離子），毛細管：0.8-3.00 kV，錐：5-30 V，源溫度：120°C-150°C，去溶劑化溫度：350°C-600°C，錐氣體流量：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：3.0 min；溶劑：A = 水 + 5% MeOH + 0.05% HCOOH，B = 乙腈 + 0.05% HCOOH；流量：0-2.5 min：0.85，然後1 ml/min，梯度：0% B等度持續0.2 min，然後在2.3 min內0%-10% B，在0.05 min內10%-100% B流量1 ml/min，100% B等度持續0.2 min，在0.05 min內100%-0% B，0% B等度持續0.2 min。

方法D

【0250】 在以下者上記錄光譜：來自沃特斯公司的質譜儀（SQD、SQDII或QDA單四極桿質譜儀），其裝備有電灑源（極性：正離子和負離子），毛細管：0.8-3.00 kV，錐：5-30 V，源溫度：120°C-150°C，去溶劑化溫度：350°C-600°C，錐氣體流量：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：在

1.0 min內10%-40% B，40% B等度持續0.1 min，然後在1.0 min內40%-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0.1 min。

方法安捷倫

【0251】 在以下者上記錄光譜：來自安捷倫科技公司（Agilent Technologies）的質譜儀（6410三重四極桿MS，Agilent 1200 Series HPLC），其裝備有電灑源（ESI，正和負極性轉換，掃描類型：MS2），毛細管：7.00 kV，碎裂電壓：120.00 V，氣體溫度350°C，氣體流量（L/min）：11，噴霧器氣體（psi）：40，質量範圍：110至650 Da，VWD波長：254 nm。優化的層析參數如下：管柱：KINETEX EVO C18，管柱長：50 mm，管柱內徑：4.6 mm，粒度：2.6 μ，管柱溫箱溫度：40°C。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

方法SQD

【0252】 在以下者上記錄光譜：來自沃特斯公司的Acquity SQD質譜儀（HPLC: UPLC 'H'級），其裝備有電灑源（ESI，正和負極性轉換，掃描類型：全部掃描），毛細管（kV）：3.00，錐電壓（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，錐氣體流量（L/Hr）：

50，質量範圍：110至800 Da，PDA波長範圍：210 nm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。優化的層析參數如下：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）
0.0	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

方法QDA

【0253】 在以下者上記錄光譜：來自沃特斯公司的Acquity QDA質譜儀（HPLC: UPLC 'H'級），其裝備有電灑源（ESI，正和負極性轉換，掃描類型：全部掃描），毛細管（kV）：0.8，錐電壓（V）：25.00，源溫度（°C）：120，去溶劑化氣體流量（L/Hr）：1000，去溶劑化溫度（°C）：600，錐氣體流量（L/Hr）：50，質量範圍：110至850 Da，PDA波長範圍：230 nm至400 nm。優化的層析參數如下：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，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

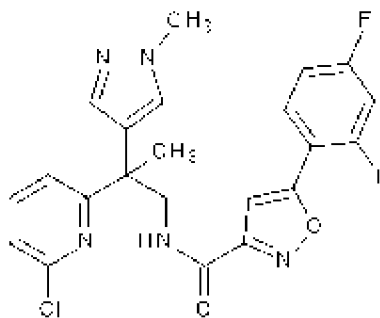
方法HSS

【0254】 光譜記錄在來自沃特斯公司的ACQUITY質譜儀（SQD或SQDII單四極桿質譜儀）上，其裝備有電灑源（極性：正離子或負離子），毛細管：3.0 kV，錐：30 V，提取器：3.00 V，源溫度：150°C，去溶劑化溫度：400°C，錐氣體流量：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2.5 min內；流量（ml/min）0.75。

製備實施例

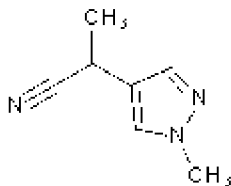
【0255】 根據本發明之具有式 (I) 之化合物可以使用以上和以下所描述的合成技術製備。

實施例1： N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺（化合物P-10，表T1）的製備



(化合物P-10，表T1)

步驟1：2-(1-甲基吡唑-4-基)丙腈的製備

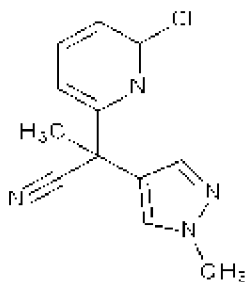


【0256】 在氬氣下，將2-(1-甲基-1h-吡唑-4-基)乙腈樣本（10.00 g，78.42 mmol）溶解在四氫呋喃（314 mL）中，並且將淡黃色溶液冷卻至-78°C。向該溶液中逐滴添加正丁基鋰（31 mL，78.42 mmol）並且將所得的淡棕色懸浮液在該溫度下攪拌25分鐘。在此時間之後，逐滴添加碘甲烷（11.24 g，4.93 mL，78.42 mmol）。將所得的棕色溶液在-78°C下攪拌5分鐘，使其升溫至室溫並在氬氣下攪拌30分鐘。將反應混合物傾倒入水中，並且用乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機層用鹽水洗滌一次，經無水硫酸鈉乾燥，過濾並在真空下濃縮以給出呈淺棕色液體的2-(1-甲基吡唑-4-基)丙腈。

【0257】 LC/MS（方法A）；136 [M+H]⁺；保留時間：0.43 min，0.44 min，0.55 min。

【0258】 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 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)。

步驟2：2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙腈的製備

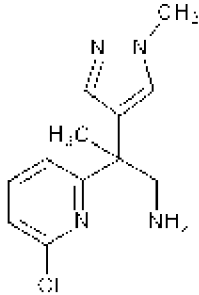


【0259】 在氬氣下，將2-(1-甲基吡啶-4-基)丙腈樣本（2.00 g，14.80 mmol）溶解在四氫呋喃（59.18 mL）中以給出淡黃色溶液。將溶液冷卻至-78°C，並且然後滴加正丁基鋰（5.90 mL，14.80 mmol）進行處理。在分批添加2,6-二氯吡啶（2.23 g，14.80 mmol）之前，將所得的淡棕色懸浮液在此溫度下攪拌10分鐘。將所得的棕色懸浮液在-78°C下攪拌5分鐘，使其達到室溫並在氬氣下攪拌30分鐘以給出淺棕色溶液。將反應混合物傾倒入水中並且用乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機層用鹽水洗滌一次，經無水硫酸鈉乾燥，過濾並在60°C下在真空下濃縮以給出3.68 g的深棕色液體。將粗產物用在環己烷中的乙酸乙酯洗提液藉由快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-甲基吡啶-4-基)丙腈（2.71 g，74.2產率）。

【0260】 LC/MS（方法A）；247 [M+H]⁺；保留時間：0.82 min。

【0261】 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) 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)。

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

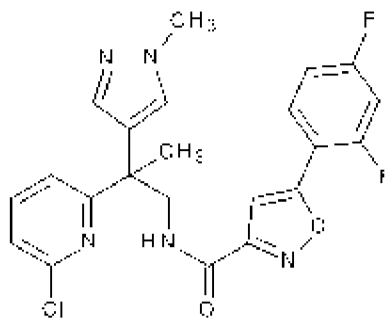


【0262】 在室溫下在氬氣下，將2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙

腓（2.71 g，11.0 mmol）在四氫呋喃（33.0 mL）中的溶液用BMS（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。將反應混合物冷卻至0°C，然後逐滴添加濃鹽酸（7.36 mL，44.2 mmol）。然後將反應混合物在50°C下攪拌1小時。將反應混合物冷卻並用水處理。將反應混合物用NaOH 6 N中和至pH 12並且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，並且在真空下濃縮以給出呈淡黃色油狀物的2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙-1-胺，其不經進一步純化而可以用於下一步驟中。

【0263】 ¹H NMR (400 MHz, DMSO d6) 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)。

步驟4：N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺（化合物P-10，表T1）的製備



（化合物P-10，表T1）

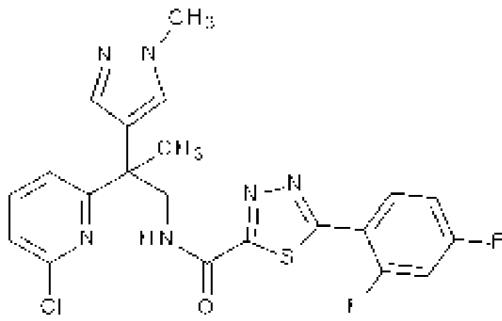
【0264】 在氫氣下，將(1-氰基-2-乙氧基-2-側氧基伸乙基胺基氧基)二甲基胺基-咪啉代-碳鎗-六氟磷酸鹽（COMU）（0.10 g，0.23 mmol）添加到2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙-1-胺（0.05 g，0.20 mmol）、5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲酸（0.05 g，0.22 mmol，如WO 2018/019929中所描述的製備）和N,N-二異丙基乙胺（0.05 g，0.07 mL，0.40 mmol）在2-MeTHF（2.0 mL）中的白色懸浮液中。反應完成後，將反應混合物用乙酸乙酯稀釋，並且將分離的乙酸乙酯相用

10 ml 0.05 M HCl水溶液洗滌一次，用飽和碳酸氫鈉水溶液洗滌一次，並且然後經無水Na₂SO₄乾燥，過濾並在真空下濃縮，以給出淡棕色油狀粉末。將粗混合物首先用在環己烷中的乙酸乙酯洗提藉由快速層析法來純化並且然後在水中的乙腈洗提藉由快速層析法來純化，以給出呈白色粉末的N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺。

【0265】 LC/MS (方法A)；458 [M+H]⁺；保留時間：1.08 min。

【0266】 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.74 (s, 3 H) 3.89 (s, 3 H) 4.01 - 4.15 (m, 2 H) 6.96 - 7.16 (m, 4 H) 7.23 - 7.31 (m, 3 H) 7.60 (t, *J*=7.81 Hz, 1 H) 7.94 (qd, *J*=8.90, 6.36 Hz, 2 H)。

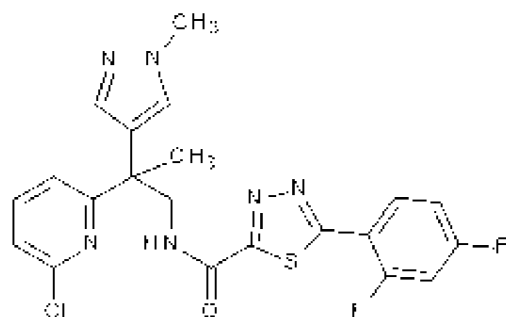
實施例2：N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噁二唑-2-甲醯胺（化合物P-9，表T1）的製備



（化合物P-9，表T1）

【0267】 步驟1-3與實施例1相同。

步驟4：N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噁二唑-2-甲醯胺（化合物P-9，表T1）的製備



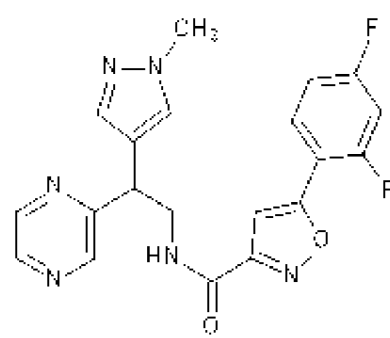
(化合物P-9，表T1)

【0268】 在氬氣氣氛下，將三甲基鋁（0.20 mL，0.40 mmol）逐滴添加到5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噁二唑-2-甲酸乙酯（0.070 g，0.26 mmol，如WO 2019/014308中所描述的製備）在0.4 ml甲苯中的淡米色懸浮液中（氣體逸出和放熱添加）。將所得的淡棕色溶液在室溫下攪拌15分鐘。然後在室溫下逐滴添加2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙-1-胺（0.05 g，0.20 mmol）在0.4 ml甲苯中的淡棕色溶液（氣體逸出）。將所得的黃色溶液在氬氣下在90°C下攪拌2小時。將反應混合物冷卻至0°C並藉由添加HCl 1 M（0.25 mL）小心地淬滅。將混合物用飽和的NaHCO₃稀釋並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，過濾並在真空下濃縮以給出粗產物，將其在水中的乙腈洗提藉由快速層析法來純化以給出呈白色粉末的標題化合物。

【0269】 LC/MS（方法A）；475 [M+H]⁺；保留時間：1.08 min。

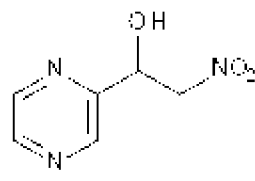
【0270】 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.75 (s, 3 H) 3.89 (s, 3 H) 4.05 - 4.20 (m, 2 H) 7.00 - 7.18 (m, 3 H) 7.24 - 7.30 (m, 3 H) 7.60 (t, *J*=7.81 Hz, 1 H) 8.31 (br t, *J*=6.18 Hz, 1 H) 8.45 (td, *J*=8.54, 6.54 Hz, 1 H)。

實施例3：5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(1-甲基吡唑-4-基)-2-吡啶-2-基-乙基]異噁唑-3-甲醯胺（化合物P-8，表T1）的製備



(化合物P-8，表T1)

步驟1：2-硝基-1-吡啶-2-基-乙醇的製備

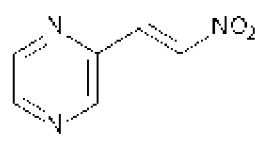


【0271】 向圓底燒瓶中添加在10 mL硝基甲烷中的2-吡啶甲醛（770 mg，7.12 mmol），隨後添加三乙胺（721 mg，7.12 mmol）。將反應混合物在室溫下攪拌1小時。然後在真空下濃縮反應混合物，並將殘餘物裝載到快速層析管柱上。將管柱用在CH₂Cl₂中的0%-5%甲醇洗提。將產物餾分收集並濃縮，以得到2-硝基-1-吡啶-2-基-乙醇。

【0272】 LC/MS（方法A）；170 [M+H]⁺；保留時間：0.26 min。

【0273】 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 3.81 (br s, 1 H) 4.69 - 4.82 (m, 1 H) 4.96 (dd, *J*=13.62, 3.45 Hz, 1 H) 5.61 (dd, *J*=8.36, 3.27 Hz, 1 H) 8.55 - 8.62 (m, 2 H) 8.88 (s, 1 H)。

步驟2：2-[(E)-2-硝基乙烯基]吡啶的製備



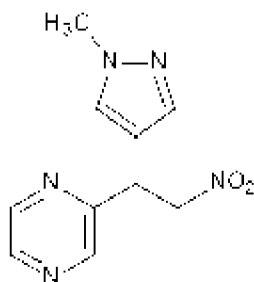
【0274】 將2-硝基-1-吡啶-2-基-乙醇（0.80 g，4.69 mmol）在無水CH₂Cl₂（10 mL）中的溶液冷卻至-20°C。添加三氟乙酸酐（0.38 mL，5.85 mmol），保持溫度低於-10°C。添加三氟乙酸酐後，將溶液攪拌兩分鐘。然後逐滴添加三乙

胺 (TEA, 1.49 mL, 10.64 mmol), 同時將溶液保持低於-10°C。添加鹼後, 溶液變得均勻, 並且呈橙色/棕色。添加TEA後, 將溶液攪拌15分鐘。將該溶液用更多的CH₂Cl₂稀釋並用飽和的氯化銨溶液洗滌。將水層用CH₂Cl₂ (2 × 50 mL) 萃取並且將合併的有機層用鹽水洗滌, 經Na₂SO₄乾燥, 過濾並在真空下濃縮。將粗棕色固體殘餘物懸浮在300 mL熱乙酸乙酯中並過濾。在真空下濃縮濾液。將殘餘物藉由快速層析法純化, 並且用在環己烷中的50%乙酸乙酯洗提, 以產生呈亮黃色固體的2-[(E)-2-硝基乙基]吡啶。

【0275】 LC/MS (方法A); 152 [M+H]⁺; 保留時間: 0.52 min。

【0276】 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 7.98 (d, *J*=1.00 Hz, 1 H) 8.07 (d, *J*=1.00 Hz, 1 H) 8.68 (s, 2 H) 8.75 (s, 1 H)。

步驟3: 2-[1-(1-甲基吡唑-4-基)-2-硝基-乙基]吡啶的製備



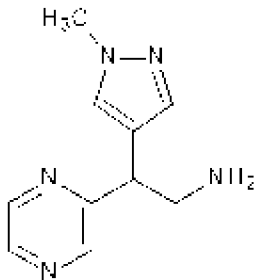
【0277】 在氬氣下, 將4-碘-1-甲基-1h-吡唑 (0.19 g, 0.89 mmol) 和四氫呋喃 (0.89 mL) 裝入配備有磁力攪拌棒的圓底燒瓶中以給出無色的溶液。在0°C下逐滴添加異丙基氯化鎂氯化鋰錯合物 (0.68 mL, 0.89 mmol)。在氬氣下, 將所得的白色混濁溶液在0°C下攪拌20分鐘。向該溶液中添加2-[(E)-2-硝基乙基]吡啶 (0.13 g, 0.89 mmol), 並將所得的淡黃色溶液在0°C下攪拌10分鐘, 並且然後使其升溫至室溫, 並在氬氣下攪拌1小時。將反應混合物傾倒入60 ml的水中並且用30 ml的乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機層用鹽水洗滌一次、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並在真空下濃縮。將粗產物藉由快速層析法 (矽膠, 梯度: 在環己

烷中的乙酸乙酯) 純化以得到2-[1-(1-甲基吡唑-4-基)-2-硝基-乙基]吡啶。

LC/MS (方法A) ; 234 [M+H]⁺ ; 保留時間 : 0.56 min

【0278】 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 3.88 (s, 3 H) 4.84 (dd, *J*=13.81, 6.54 Hz, 1 H) 5.00 (dd, *J*=8.17, 6.72 Hz, 1 H) 5.27 (dd, *J*=13.44, 8.36 Hz, 1 H) 7.30 (s, 1 H) 7.42 (s, 1 H) 8.49 - 8.60 (m, 3 H) 。

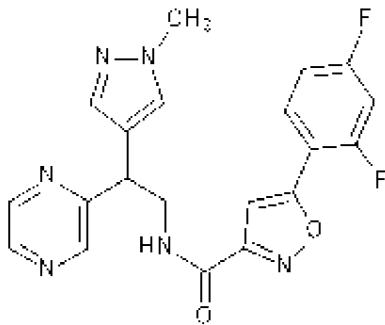
步驟4 : 2-(1-甲基吡唑-4-基)-2-吡啶-2-基-乙胺的製備



【0279】 將2-[1-(1-甲基吡唑-4-基)-2-硝基-乙基]吡啶(0.11 g, 0.47 mmol)、氯化銨(0.51 g, 9.43 mmol)和鋅(0.62 g, 9.43 mmol)在四氫呋喃(0.47 mL)和甲醇(0.47 mL)中的混合物在室溫下攪拌4.5小時。將混合物用乙酸乙酯(20 mL)稀釋並通過celite過濾。將濾液在真空下濃縮，並且作為粗品用於下一步驟中。

【0280】 LC/MS (方法A) ; 204 [M+H]⁺ ; 保留時間 : 0.16 min 。

步驟5 : 5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(1-甲基吡唑-4-基)-2-吡啶-2-基-乙基]異噁唑-3-甲醯胺(化合物P-8, 表T1)的製備



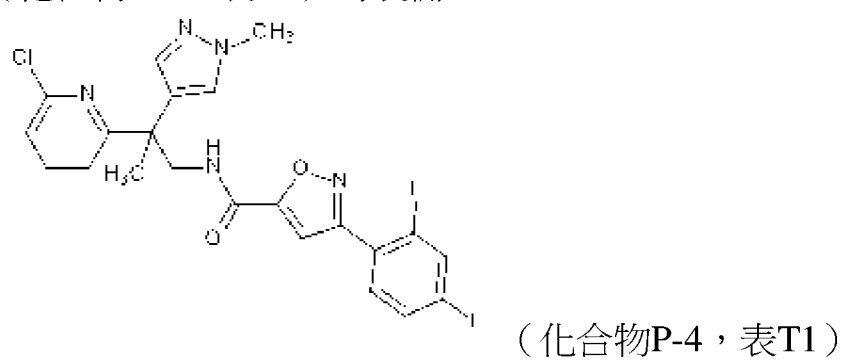
(化合物P-8, 表T1)

【0281】 將2-[(E)-2-硝基乙烯基]吡啶(0.10 g, 0.49 mmol)、乙酸乙酯(4.92 mL)、N,N-二異丙基乙胺(0.25 mL, 1.48 mmol)和5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲酸(0.12 g, 0.54 mmol)裝入配備有磁力攪拌棒的圓底燒瓶中。然後在室溫下逐滴添加丙膦酸酐(0.87 mL, 1.48 mmol),並將混合物在室溫下攪拌1小時。將反應混合物用飽和的NaHCO₃水溶液淬滅並用乙酸乙酯(3×20 mL)萃取。將合併的有機層用鹽水洗滌,經硫酸鈉乾燥並在真空下濃縮。將粗產物使用環己烷和乙酸乙酯作為洗提液(梯度在環己烷中的1%至100%乙酸乙酯)藉由快速層析法來純化,以產生呈淡黃色固體的標題化合物。

【0282】 LC/MS (方法A); 211 [M+H]⁺; 保留時間: 0.85 min。

【0283】 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 3.89 (s, 3 H) 4.09 - 4.19 (m, 2 H) 4.51 (dd, *J*=7.81, 6.36 Hz, 1 H) 6.95 - 7.11 (m, 3 H) 7.35 (s, 1 H) 7.38 - 7.48 (m, 2 H) 7.93 (td, *J*=8.54, 6.18 Hz, 1 H) 8.51 (dd, *J*=8.90, 2.00 Hz, 2 H) 8.61 (dd, *J*=2.54, 1.45 Hz, 1 H)。

實施例4： N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-3-(2,4-二氟苯基)異噁唑-5-甲醯胺 (化合物P-4, 表T1) 的製備



【0284】 步驟1-3與實施例1相同。

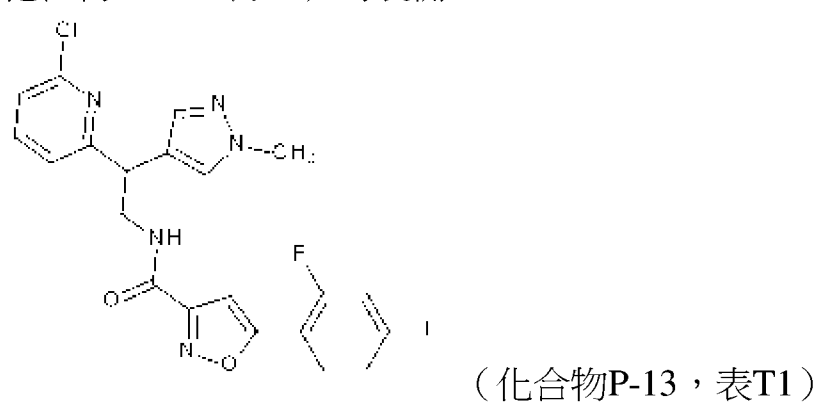
步驟4： N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-3-(2,4-二氟苯基)異噁唑-5-甲醯胺 (化合物P-4, 表T1) 的製備

【0285】 在氬氣下，將COMU（0.14 g，0.32 mmol）添加到2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙-1-胺（0.070 g，0.28 mmol）、3-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-5-羧酸（0.073 g，0.31 mmol）和N,N-二異丙基乙胺（0.073 g，0.098 mL，2.0，0.56 mmol）在2-MeTHF（2.8 mL）中的無色溶液中。將所得的黃色懸浮液在室溫下攪拌30分鐘以給出淺黃色溶液。將反應混合物用乙酸乙酯稀釋，並且將分離的有機相用10 ml 0.05 M HCl水溶液洗滌，用飽和碳酸氫鈉水溶液洗滌，並且然後經無水Na₂SO₄乾燥，過濾並在真空下濃縮，以給出淡黃色油狀粉末。將粗產物用在環己烷中的乙醇/乙酸乙酯梯度藉由快速層析法純化，並且然後在水中的乙腈梯度藉由快速層析法進一步純化，以給出呈無色油狀粉末的標題化合物。

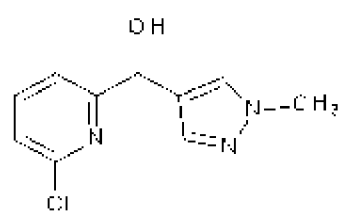
【0286】 LC/MS（方法A）；458 [M+H]⁺；保留時間：1.03 min。

【0287】 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.73 (s, 3 H) 3.89 (s, 3 H) 4.00 - 4.11 (m, 2 H) 6.94 - 7.06 (m, 2 H) 7.13 (dd, *J*=7.63, 0.73 Hz, 1 H) 7.24 - 7.34 (m, 4 H) 7.62 (t, *J*=7.81 Hz, 1 H) 7.97 - 8.04 (m, 1 H) 8.08 (br t, *J*=5.99 Hz, 1 H)。

實施例5： N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)乙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺（化合物P-13，表T1）的製備



步驟1：(6-氯-2-吡啶基)-(1-甲基吡啶-4-基)甲醇的製備

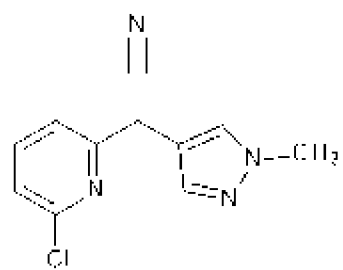


【0288】 在氬氣下，將4-碘-1-甲基-1h-吡唑（3.20 g，15.1 mmol）和四氫呋喃（54.8 mL）裝入配備有磁力攪拌棒的3頸圓底燒瓶中以給出無色的溶液。在0°C下逐滴添加異丙基氯化鎂氯化鋰錯合物（17 mL，21.9 mmol）。在氬氣下，將所得的白色混濁溶液在0°C下攪拌20分鐘。向該溶液中添加6-氯吡啶-2-甲醛（2.00 g，13.7 mmol），並將所得的黃色懸浮液在0°C下攪拌10分鐘，並且然後使其升溫至室溫，並在氬氣下攪拌4小時。將反應混合物傾倒入60 ml的水中並且用30 ml的乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機層用鹽水洗滌一次、經無水硫酸鈉乾燥、過濾並在真空下濃縮以給出粗化合物。將粗產物用在環己烷中的乙酸乙酯梯度藉由快速層析法純化以給出呈淡黃色油狀物的標題化合物。

【0289】 LC/MS（方法A）；224 [M+H]⁺；保留時間：0.58 min。

【0290】 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 3.45 - 3.79 (br s, 1 H) 3.90 (s, 3 H) 5.80 (s, 1 H) 7.25 - 7.30 (m, 2 H) 7.36 (s, 1 H) 7.46 (s, 1 H) 7.67 (t, *J*=7.81 Hz, 1 H)。

步驟2：2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)乙腈的製備



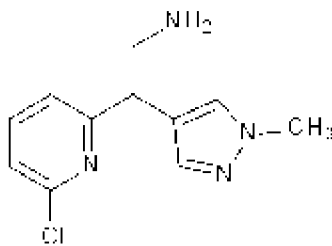
【0291】 將(6-氯-2-吡啶基)-(1-甲基吡唑-4-基)甲醇（2.35 g，10.5 mmol）溶解在二氯甲烷（168 mL）中並且然後用碳酸鋰（0.16 g，2.10 mmol）處理。在室溫下依次添加三甲基矽基氰化物（6.10 mL，47.3 mmol）和碘（4.85 g，18.9

mmol)。將所得的深淺棕色溶液在35°C下攪拌2小時。將反應混合物冷卻至室溫，並傾倒入飽和的Na₂S₂O₃水溶液中，並用二氯甲烷萃取兩次。將合併的有機層經無水硫酸鈉乾燥，過濾並在真空下濃縮，以給出2.54 g的棕色油狀固體。將粗產物用乙酸乙酯洗提液藉由快速層析法純化以給出呈淡棕色油狀物的標題化合物。

【0292】 LC/MS (方法A)；233 [M+H]⁺；保留時間：0.73 min。

【0293】 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 3.94 (s, 3 H) 5.24 (s, 1 H) 7.34 (d, *J*=7.99 Hz, 1 H) 7.42 (d, *J*=7.63 Hz, 1 H) 7.52 (d, *J*=6.90 Hz, 2 H) 7.73 (t, *J*=7.81 Hz, 1 H)。

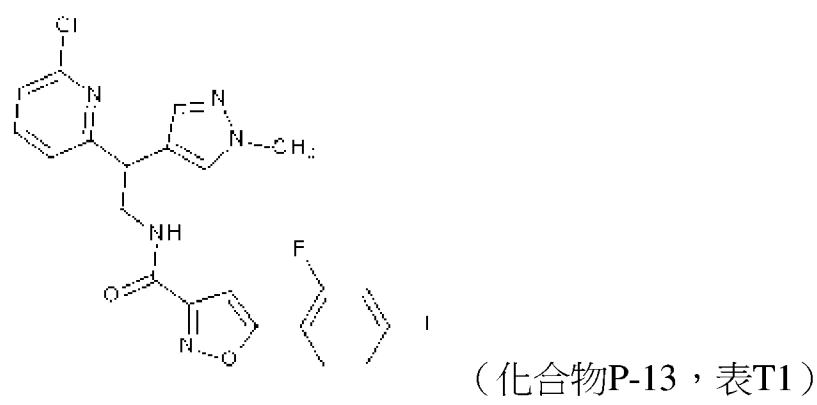
步驟3：2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)乙胺的製備



【0294】 在室溫下在氬氣下，將2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)乙脞 (0.79 g, 3.38 mmol) 在四氫呋喃 (5 mL) 中的溶液用BMS (5.07 mL, 10.1 mmol)處理，並且將所得的淺棕色溶液在65°C下攪拌1小時以給出淺紅色懸浮液。將反應混合物冷卻至0°C，然後逐滴添加鹽酸 (2.26 mL, 13.6 mmol)。將所得淡橙色懸浮液在65°C下攪拌1小時。添加一些水。然後將其用NaOH 6 N中和至pH 12並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60°C下在真空下濃縮以給出呈淡棕色油狀物的有少量雜質的2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)乙胺 (0.40 g, 50%產率)。

【0295】 LC/MS (方法A)；237 [M+H]⁺；保留時間：0.16 min和0.26 min。

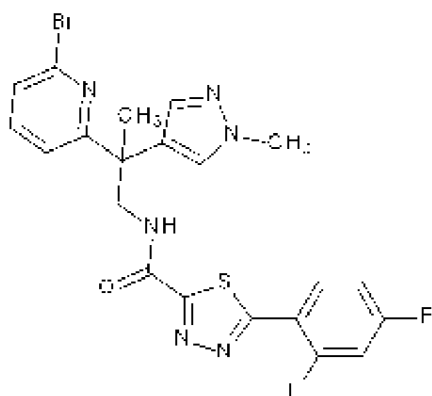
步驟4：N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)乙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺（化合物P-13，表T1）的製備



【0296】 將5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲酸（0.024 g，0.10 mmol）添加到2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)乙胺（0.022 g，1.0，0.09 mmol）在N,N-二甲基甲醯胺（0.46 mL）中的淡棕色溶液中。然後緩慢地添加N,N-二異丙基乙胺（0.049 g，0.065 mL，0.37 mmol）和(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（HATU）（0.043 g，0.11 mmol）以給出淺棕色溶液(稍微放熱添加)。將其在室溫下攪拌1小時。將反應混合物用水進行稀釋，並且然後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Na₂SO₄乾燥，過濾並在真空下濃縮以給出呈淡棕色油狀物的粗產物。將粗產物用在環己烷中的乙酸乙酯洗提藉由快速層析法來純化以給出呈淡黃色油狀物的N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)乙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺。

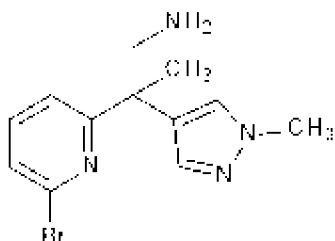
【0297】 LC/MS（方法A）；444 [M+H]⁺；保留時間：1.00 min。

實施例6：N-[2-(6-溴-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噁二唑-2-甲醯胺（化合物P-5，表T1）的製備



(化合物P-5，表T1)

步驟1：2-(6-溴-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙-1-胺的製備



【0298】 在氬氣下，將2-(1-甲基吡唑-4-基)丙腈 (0.10 g, 0.74 mmol, 如先前在實施例1，步驟1中所描述的製備) 溶解在四氫呋喃 (3.00 mL) 中，並將淡黃色溶液冷卻至-78°C。向該溶液中逐滴添加正丁基鋰 (0.30 mL, 0.74 mmol)，並且將所得的淡棕色懸浮液在該溫度下攪拌10分鐘，然後添加2,6-二溴吡啶 (0.18 g, 0.74 mmol)。將所得的棕色懸浮液在-78°C下攪拌5分鐘，使其升溫至室溫，並在氬氣下攪拌30分鐘以給出呈黃色溶液的在THF中的2-(6-溴-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙腈。

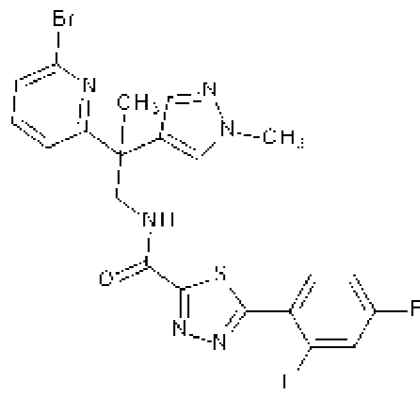
【0299】 LC/MS (方法A)；291 [M+H]⁺；保留時間：0.83 min。

【0300】 在室溫下在氬氣下，向該溶液中添加BMS (0.38 mL, 4.03 mmol)，並將所得的無色溶液在65°C下攪拌1小時。然後將反應混合物冷卻至0°C，並且逐滴添加濃鹽酸 (0.90 mL, 5.40 mmol)。將反應混合物在65°C下攪拌30分鐘。將反應混合物用水稀釋，並且然後用NaOH 6 N處理，以將混合物調節至pH 10。將混合物用乙酸乙酯萃取三次，並且將合併的有機層用鹽水洗滌，經無水硫酸鈉乾燥，並在真空下濃縮，以給出呈無色油狀物的2-(6-溴-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑

-4-基)丙-1-胺。

【0301】 LC/MS (方法A) ; 295 [M+H]⁺ ; 保留時間 : 0.47 min 。

步驟2 : N-[2-(6-溴-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噁二唑-2-甲醯胺 (化合物P-5 , 表T1) 的製備



(化合物P-5 , 表T1)

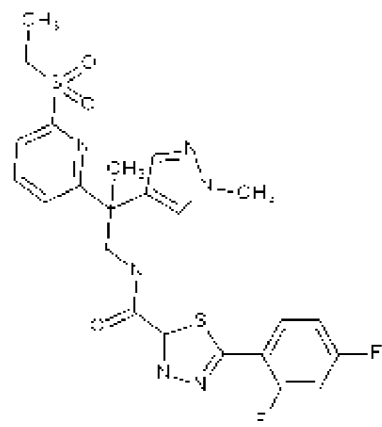
【0302】 在氬氣下，將三甲基鋁 (0.86 mL , 1.73 mmol) 逐滴添加到2-(6-溴-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙-1-胺 (0.26 g , 0.86 mmol) 和5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噁二唑-2-羧酸乙酯 (0.30 g , 1.12 mmol) 在甲苯 (3.46 mL) 中的淺棕色懸浮液中。將所得的深淺棕色溶液在90°C下在氬氣下攪拌1小時。將反應混合物冷卻至0°C並藉由添加HCl 1 M (1 mL) 小心地淬滅。將混合物用一些飽和的NaHCO₃稀釋並用乙酸乙酯萃取兩次。將合併的有機層用鹽水洗滌一次，經無水硫酸鈉乾燥，過濾並在真空下濃縮以給出呈淺棕色油狀物的粗產物。將其用在環己烷中的乙醇/乙酸乙酯洗提液藉由使用快速層析法來純化以給出呈黃色粉末的N-[2-(6-溴-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噁二唑-2-甲醯胺。

【0303】 LC/MS (方法A) ; 419 [M+H]⁺ ; 保留時間 : 1.08 min 。

【0304】 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.75 (s, 3 H) 3.89 (s, 3 H) 4.04 - 4.20 (m, 2 H) 7.00 - 7.13 (m, 2 H) 7.17 (d, J=7.63 Hz, 1 H) 7.25 - 7.31 (m, 1 H) 7.35 (s, 1 H) 7.37 - 7.44 (m, 1 H) 7.46 - 7.53 (m, 1 H) 8.32 (br t, J=6.18 Hz, 1 H) 8.45 (td,

$J=8.45, 6.36 \text{ Hz}, 1 \text{ H}$)。

實施例7：5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(6-乙基磺醯基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-1,3,4-噻二唑-2-甲醯胺（化合物P-3，表T1）的製備



（化合物P-3，表T1）

【0305】 在氬氣下，將乙亞磺酸鈉（0.04 g，0.31 mmol）添加到N-[2-(6-溴-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噻二唑-2-甲醯胺（0.04 g，0.08 mmol）和碘化銅(i)（0.016 g，0.09 mmol）在二甲基亞砜（DMSO，0.39 mL）中的淡綠黃色溶液中。將所得的淡棕綠色溶液在氬氣下在90°C下攪拌20小時以給出淺棕色溶液。將混合物用乙酸乙酯和水萃取。將有機層用鹽水洗滌一次，經無水Na₂SO₄乾燥，過濾並在60°C下在真空下蒸發以給出40 mg的淡棕色油狀物。將粗產物用在環己烷中的乙醇/乙酸乙酯洗提液藉由使用快速層析法來純化以給出呈淡棕色油狀物的5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(6-乙基磺醯基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-1,3,4-噻二唑-2-甲醯胺（5.5 mg，13%產率）。

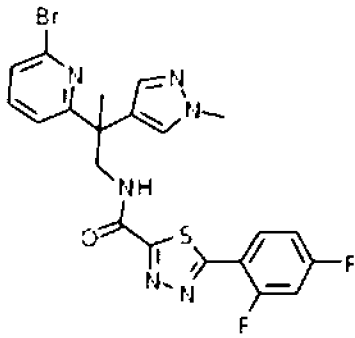
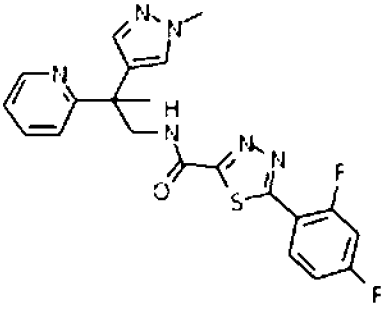
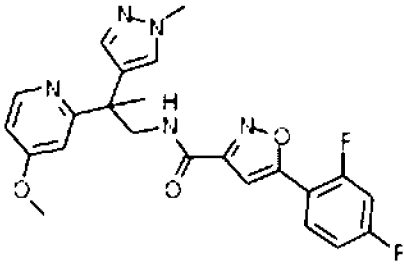
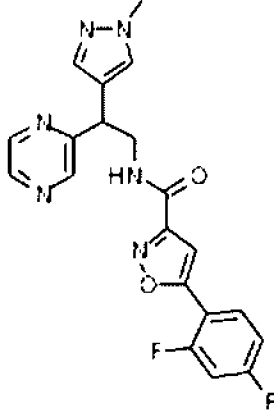
【0306】 LC/MS標準533 [M+H]⁺；保留時間：0.94 min。

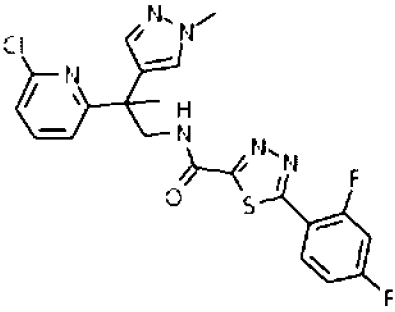
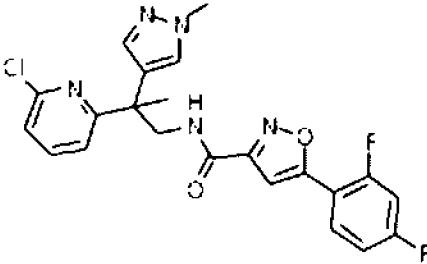
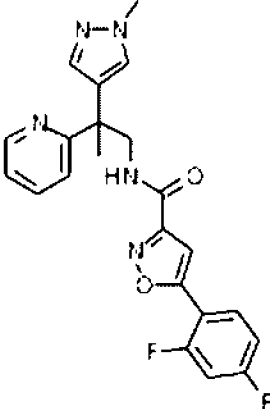
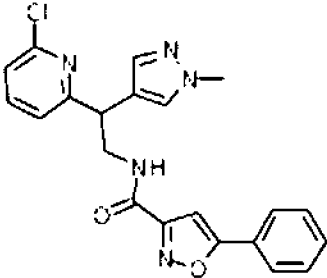
【0307】 ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 1.39 - 1.51 (t, 3 H) 1.80 (s, 3 H) 3.68 (q, $J=7.63 \text{ Hz}$, 2 H) 3.91 (s, 3 H) 4.10 - 4.25 (m, 2 H) 7.01 - 7.14 (m, 2 H) 7.29 (s, 1 H) 7.34 (s, 1 H) 7.48 (dd, $J=7.99, 0.73 \text{ Hz}$, 1 H) 7.87 - 7.97 (m, 1 H) 8.05 (dd, $J=7.63, 1.09 \text{ Hz}$, 1 H) 8.25 (br t, $J=6.54 \text{ Hz}$, 1 H) 8.43 (td, $J=8.54, 6.18 \text{ Hz}$, 1 H)。

【0308】 合成的化合物的另外的實施例示出於表T1中。

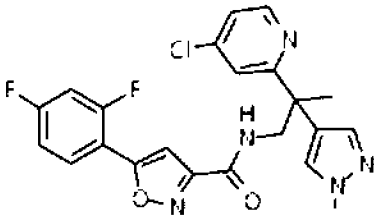
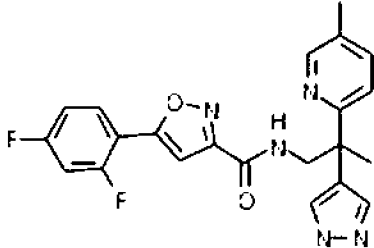
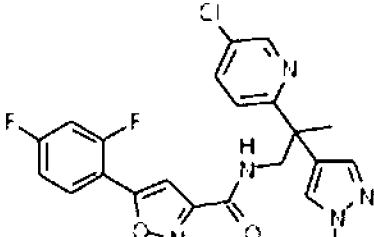
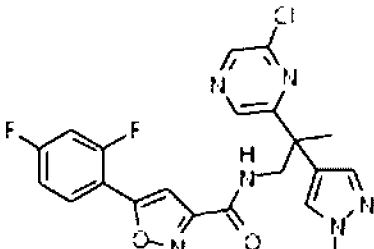
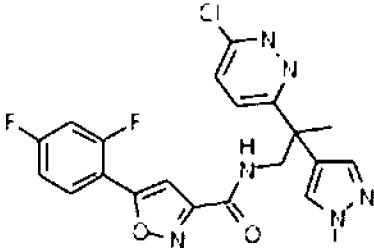
[表T1]：合成的化合物以及光譜和物理化學數據。

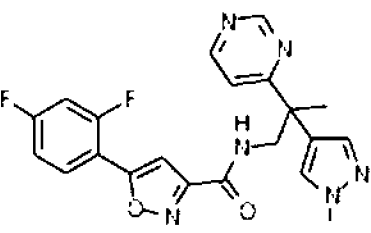
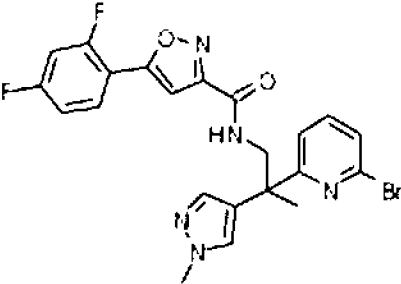
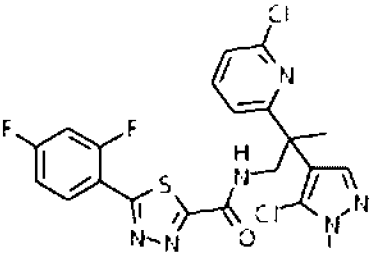
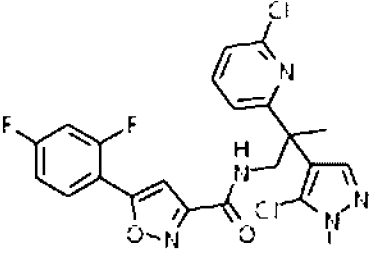
條目	IUPAC名稱	結構	RT (min)	[M+H] (測量的)	方法	MP °C
P-1	N-[2-(3-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噻二唑-2-甲醯胺		1.07	475	A	
P-2	N-[2-(3-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.07	458	A	
P-3	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(6-乙基磺醯基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-1,3,4-噻二唑-2-甲醯胺		0.94	533	A	
P-4	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-3-(2,4-二氟苯基)異噁唑-5-甲醯		0.94	533	A	

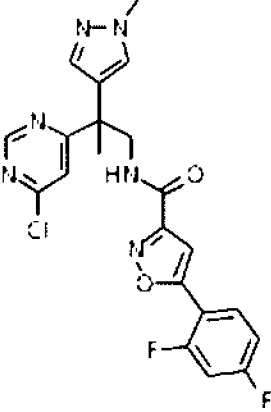
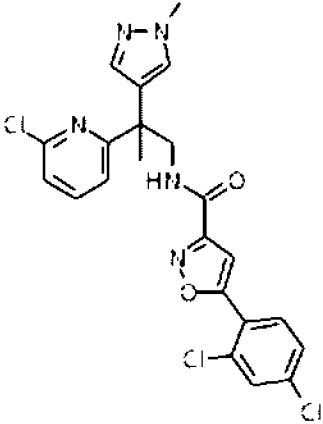
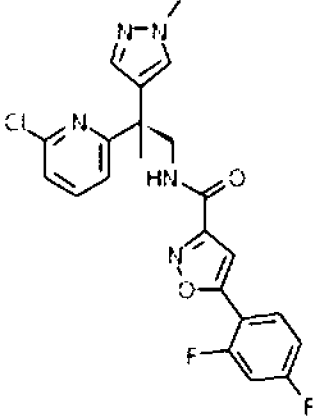
	胺					
P-5	N-[2-(6-溴-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噁二唑-2-甲醯胺		1.08	419	A	
P-6	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(1-甲基吡唑-4-基)-2-(2-吡啶基)丙基]-1,3,4-噁二唑-2-甲醯胺		0.96	441	A	
P-7	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(4-甲氧基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		0.77	454	A	
P-8	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(1-甲基吡唑-4-基)-2-吡啶-2-基-乙基]異噁唑-3-甲醯胺		0.86	411	A	

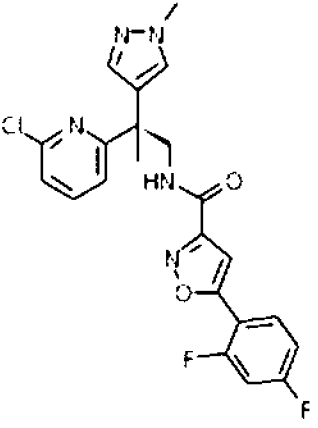
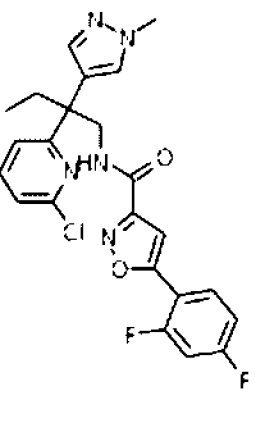
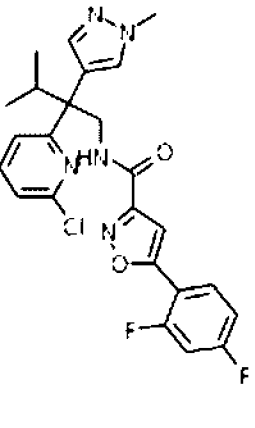
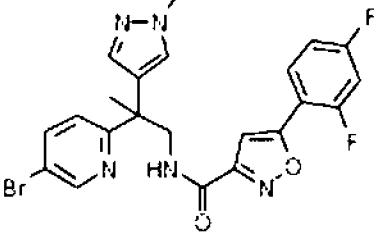
P-9	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噻二唑-2-甲醯胺		1.08	475	A	
P-10	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.08	458	A	139 - 141
P-11	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(1-甲基吡唑-4-基)-2-(2-吡啶基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		0.96	424	A	
P-12	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)乙基]-5-苯基-異噁唑-3-甲醯胺		0.97	408	A	

P-13	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)乙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.00	444	A	
P-14	N-[2-(6-氯-5-甲氧基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.07	488	A	196 - 199
P-15	N-[2-(6-氰基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		0.97	449	A	128 - 131
P-16	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(1-甲基吡唑-4-基)-2-(6-甲基-2-吡啶基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.02	438	A	
P-17	N-[2-(5-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噻二		1.09	475	A	

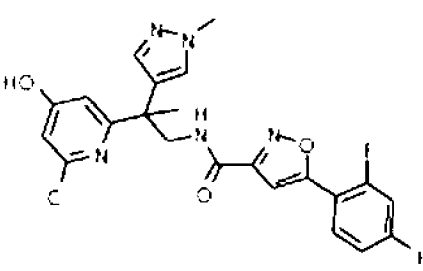
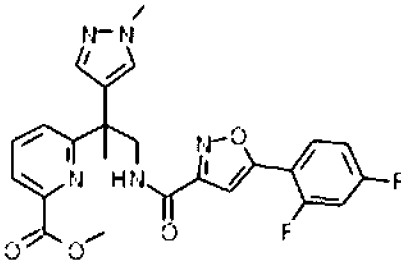
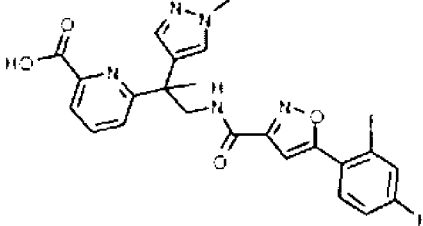
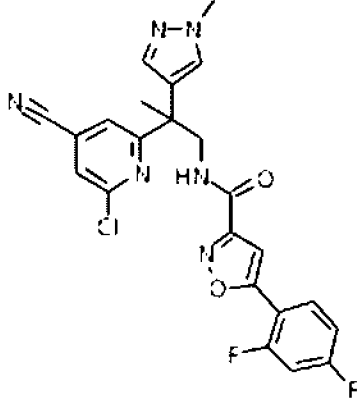
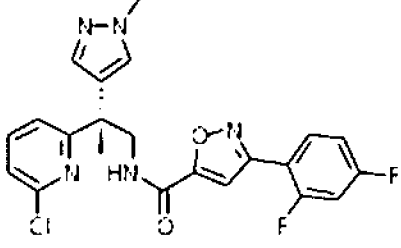
	唑-2-甲醯胺					
P-18	N-[2-(4-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.07	458	A	
P-19	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(1-甲基吡唑-4-基)-2-(5-甲基-2-吡啶基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		0.98	438	A	
P-20	N-[2-(5-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.09	458	A	
P-21	N-[2-(6-氯吡嗪-2-基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.01	459	A	
P-22	N-[2-(6-氯嘧啶-3-基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		0.96	459	A	

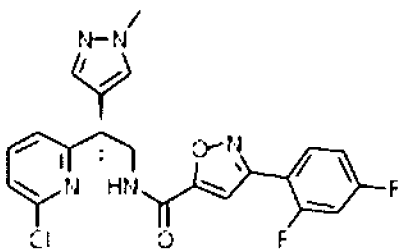
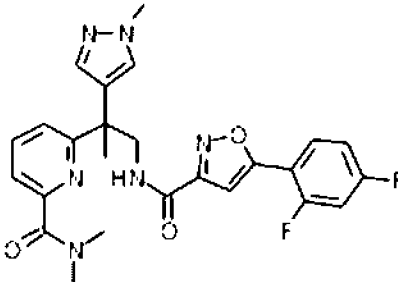
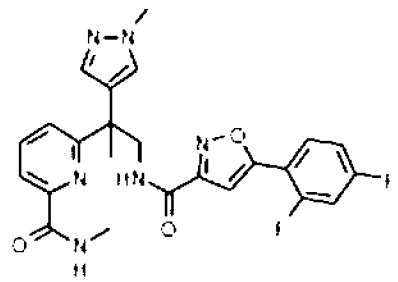
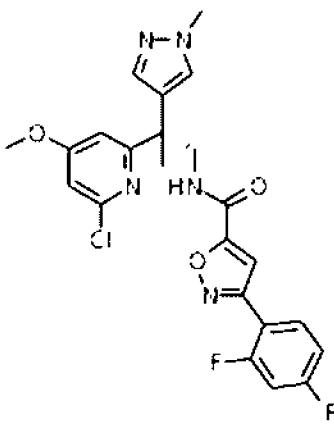
P-23	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(1-甲基吡唑-4-基)-2-嘧啶-4-基-丙基]異噁唑-3-甲醯胺		0.90	425	A	
P-24	N-[2-(6-溴-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.08	504	A	141 - 143
P-25	N-[2-(5-氯-1-甲基-吡唑-4-基)-2-(6-氯-2-吡啶基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噁二唑-2-甲醯胺		1.15	509	A	
P-26	N-[2-(5-氯-1-甲基-吡唑-4-基)-2-(6-氯-2-吡啶基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.14	492	A	

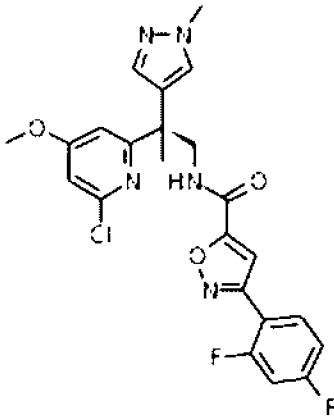
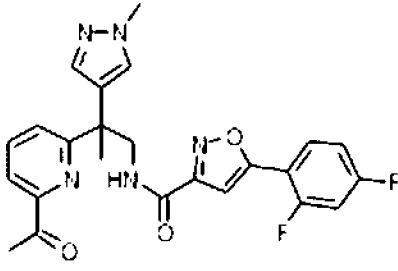
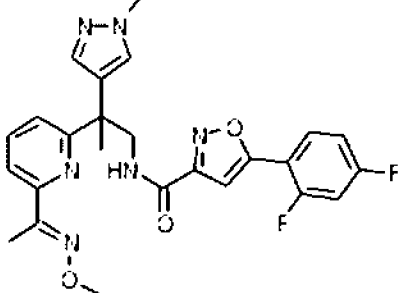
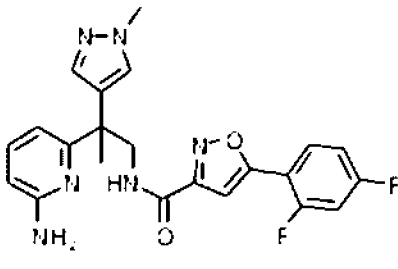
P-27	N-[2-(6-氯嘧啶-4-基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲酰胺		1.00	459	A	
P-28	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氯苯基)異噁唑-3-甲酰胺		1.17	490	A	
P-29	N-[(2S)-2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲酰胺		1.07	458	A	

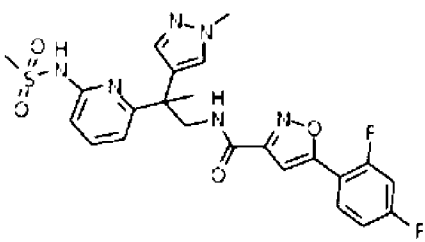
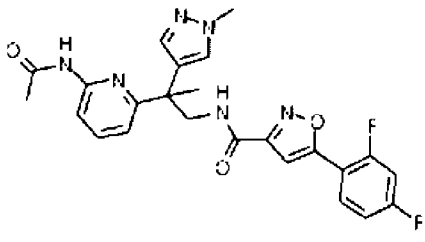
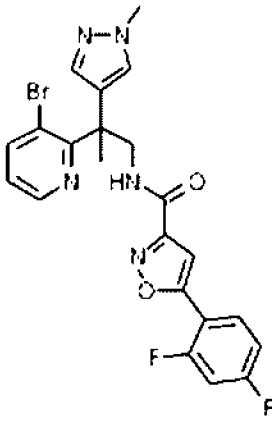
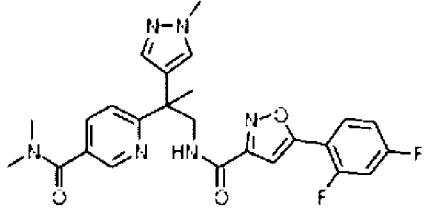
P-30	N-[(2S)-2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.07	458	A	
P-31	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丁基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.12	472	A	
P-32	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-3-甲基-2-(1-甲基吡唑-4-基)丁基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.16	486	A	
P-33	N-[2-(5-溴-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.10	504	A	

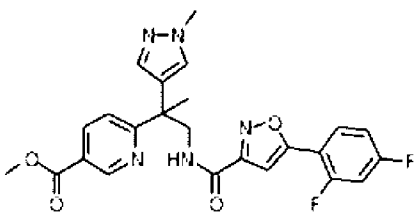
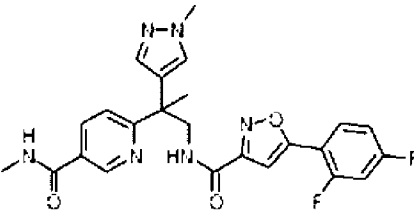
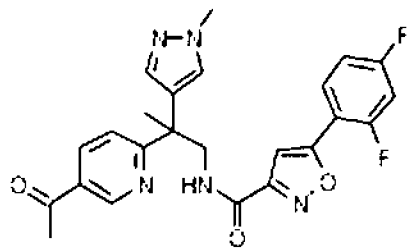
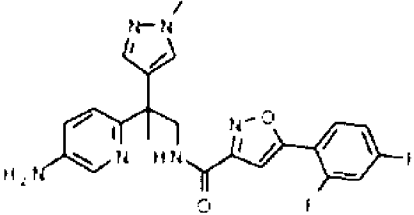
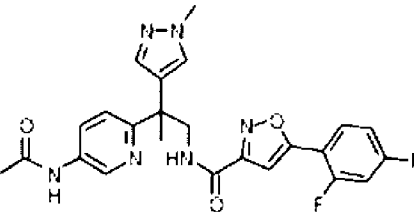
P-34	N-[(2S)-2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噻二唑-2-甲醯胺		1.08	475	A	
P-35	N-[(2R)-2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噻二唑-2-甲醯胺		1.08	475	A	
P-36	N-[2-(6-氯-4-甲氧基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.09	488	A	157 - 159
P-37	5-(2,4-二甲氧基苯基)-N-[2-(6-甲氧基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.09	478	A	

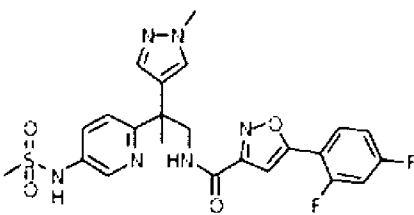
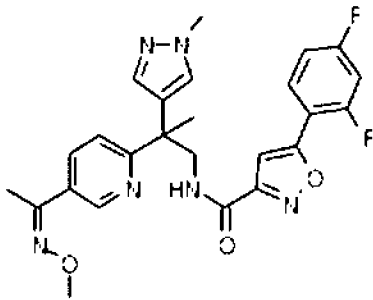
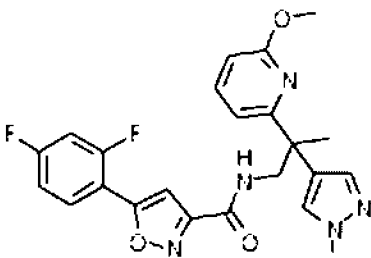
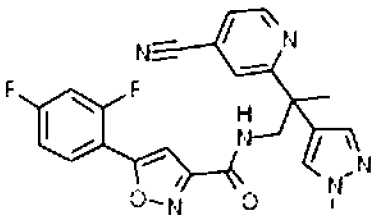
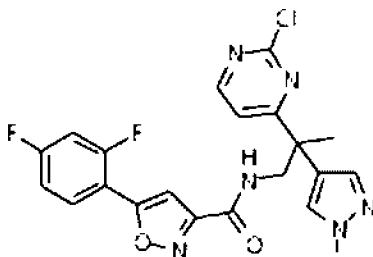
P-38	N-[2-(6-氯-4-羥基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.00	474	A	
P-39	6-[2-[[5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-羰基]胺基]-1-甲基-1-(1-甲基吡唑-4-基)乙基]吡啶-2-甲酸甲酯		1.02	482	A	
P-40	6-[2-[[5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-羰基]胺基]-1-甲基-1-(1-甲基吡唑-4-基)乙基]吡啶-2-甲酸		0.9	468	A	
P-41	N-[2-(6-氯-4-氰基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.06	483	A	
P-42	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-3-(2,4-二氟苯基)異噁唑-5-甲醯		1.04	458	A	126 - 128

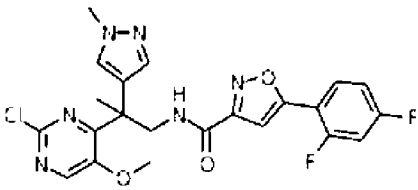
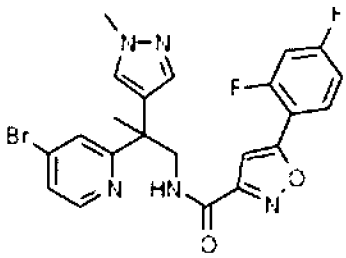
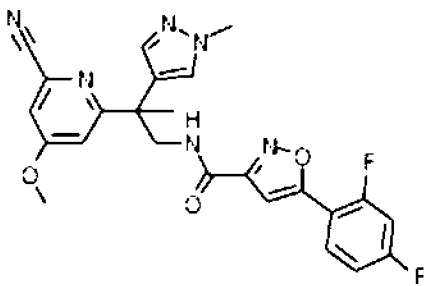
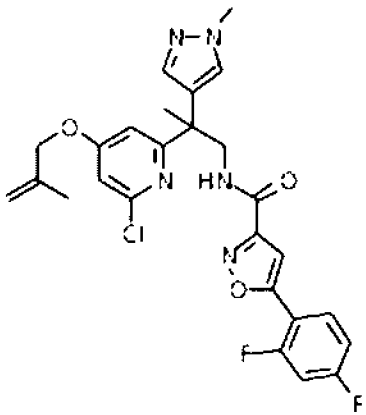
	胺					
P-43	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-3-(2,4-二氟苯基)異噁唑-5-甲醯胺		1.04	458	A	126 - 128
P-44	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[6-(二甲基胺基甲醯基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		0.92	495	A	
P-45	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[6-(甲基胺基甲醯基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		0.92	479 (M-H)	A	
P-46	N-[(2R)-2-(6-氯-4-甲氧基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-3-(2,4-二氟苯基)異噁唑-5-甲醯胺		1.09	488	A	

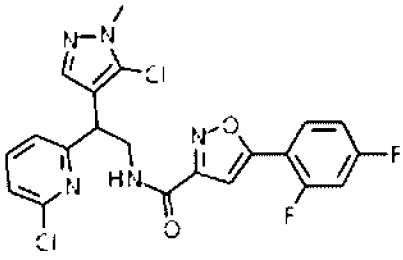
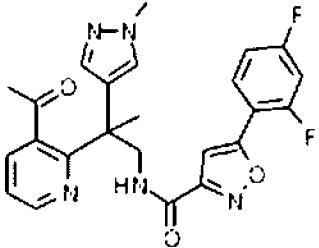
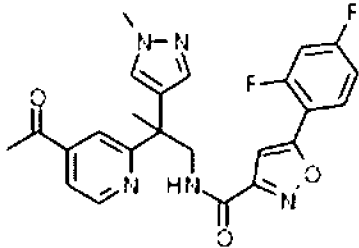
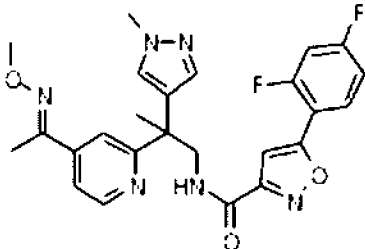
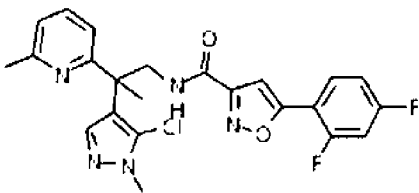
P-47	N-[(2S)-2-(6-氯-4-甲氧基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-3-(2,4-二氟苯基)異噁唑-5-甲酰胺		1.09	488	A	
P-48	N-[2-(6-乙醯基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲酰胺		1.03	466	A	
P-49	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[6-[(E)-N-甲氧基-C-甲基-碳醯亞胺基]-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲酰胺		1.15	495	A	
P-50	N-[2-(6-胺基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲酰胺		0.72	439	A	

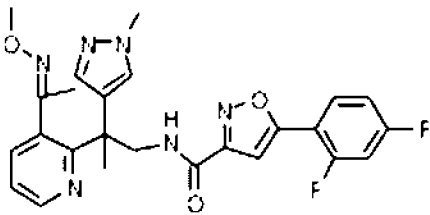
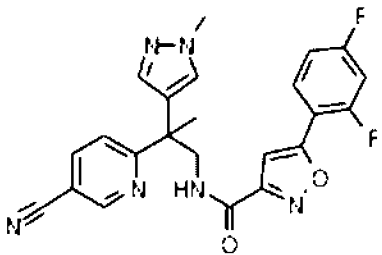
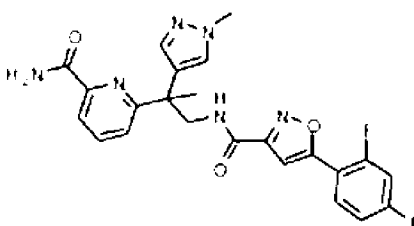
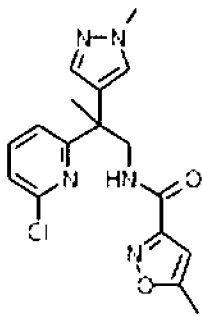
P-51	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[6-(甲磺醯胺基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		0.90	517	A	
P-52	N-[2-(6-乙醯胺基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		0.94	481	A	
P-53	N-[2-(3-溴-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.11	504	A	
P-54	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[5-(二甲基胺基甲醯基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		0.93	495	A	

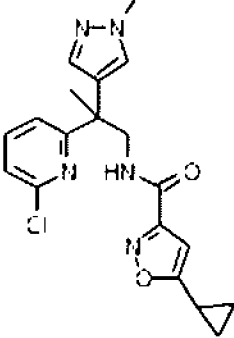
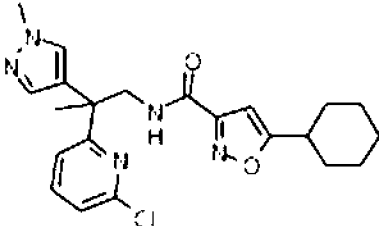
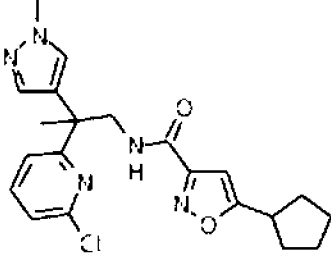
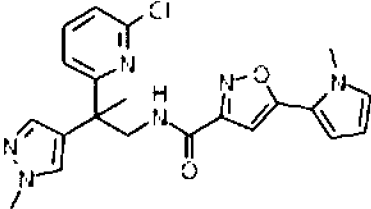
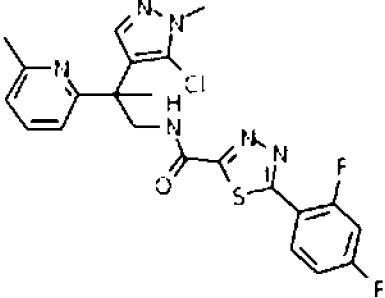
P-55	6-[2-[[5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-羰基]胺基]-1-甲基-1-(1-甲基吡唑-4-基)乙基]吡啶-3-甲酸甲酯		1.02	482	A	
P-56	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[5-(甲基胺基甲醯基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		0.91	481	A	
P-57	N-[2-(5-乙醯基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		0.98	466	A	
P-58	N-[2-(5-胺基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		0.75	439	A	
P-59	N-[2-(5-乙醯胺基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		0.90	481	A	

P-60	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[5-(甲磺醯胺基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		0.90	517	A	
P-61	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[5-[(Z)-N-甲氧基-C-甲基-碳醯亞胺基]-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.10	495	A	
P-62	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(6-甲氧基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.05	454	A	
P-63	N-[2-(4-氰基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		0.96	449	A	156 - 158
P-64	N-[2-(2-氯嘧啶-4-基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯		0.97	459	A	

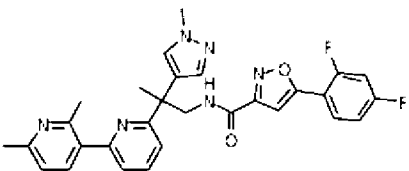
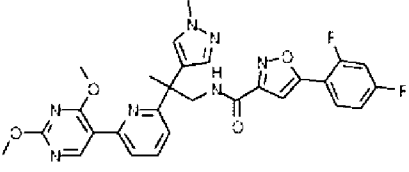
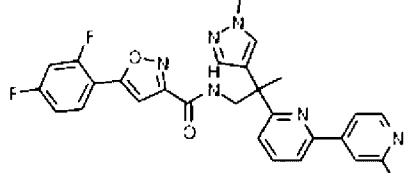
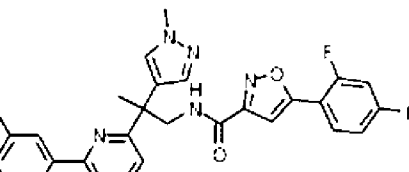
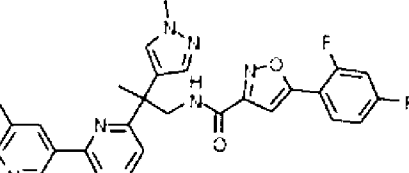
	胺					
P-65	N-[2-(2-氯-5-甲氧基-嘧啶-4-基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.00	489	A	145 - 151
P-66	N-[2-(4-溴-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.05	502	A	
P-67	N-[2-(6-氰基-4-甲氧基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		0.98	479	A	
P-68	N-[2-[6-氯-4-(2-甲基烯丙氧基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.15	528	A	

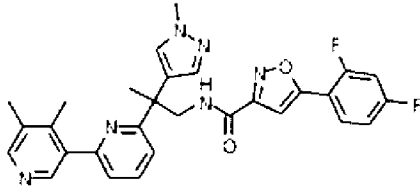
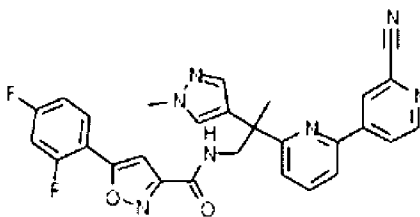
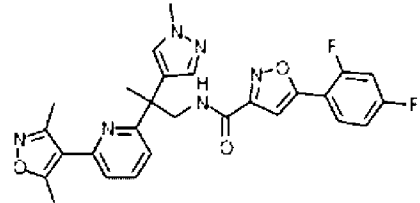
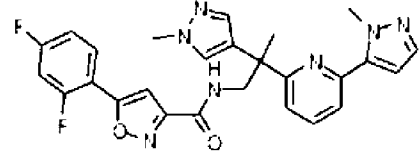
P-69	N-[2-(5-氯-1-甲基-吡唑-4-基)-2-(6-氯-2-吡啶基)乙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.05	478	A	113 - 115
P-70	N-[2-(3-乙醯基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		0.97	466	A	
P-71	N-[2-(4-乙醯基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		0.95	466	A	
P-72	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[4-[(E)-N-甲氧基-C-甲基-碳醯亞胺基]-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.07	495	A	88 - 90
P-73	N-[2-(5-氯-1-甲基-吡唑-4-基)-2-(6-甲基-2-吡啶基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑		1.08	472	A	

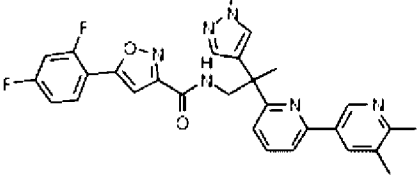
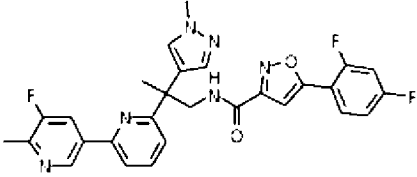
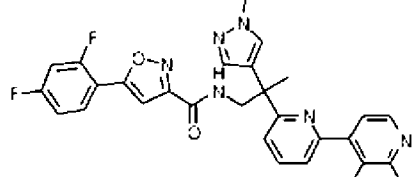
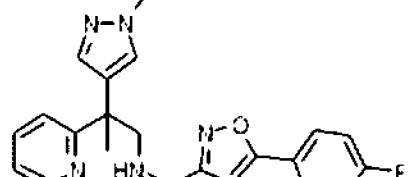
	-3-甲醯胺					
P-74	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[3-[(Z)-N-甲氧基-C-甲基-碳醯亞胺基]-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.06	495	A	
P-75	N-[2-(5-氰基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		0.98	449	A	
P-76	N-[2-(6-胺基甲醯基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		0.85	467	A	
P-77	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-甲基-異噁唑-3-甲醯胺		1.02	360	SQ D	

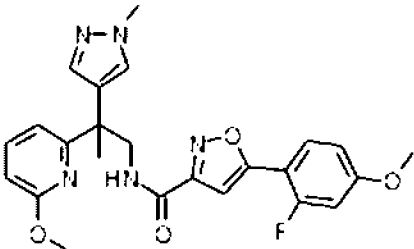
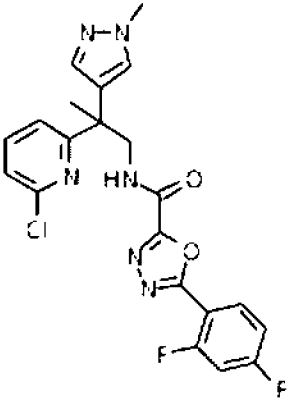
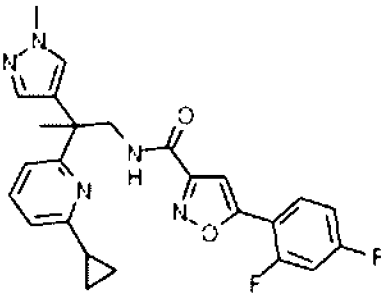
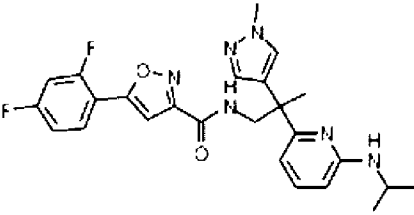
P-78	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-環丙基-異噁唑-3-甲醯胺		1.11	386	QD A	
P-79	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-環己基-異噁唑-3-甲醯胺		1.60	428	安捷倫	
P-80	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-環戊基-異噁唑-3-甲醯胺		1.56	414	安捷倫	
P-81	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(1-甲基吡咯-2-基)異噁唑-3-甲醯胺		1.48	425	安捷倫	111 - 113
P-82	N-[2-(5-氯-1-甲基-吡唑-4-基)-2-(6-甲基-2-吡啶基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噁二唑-2-甲醯胺		1.11	489	A	

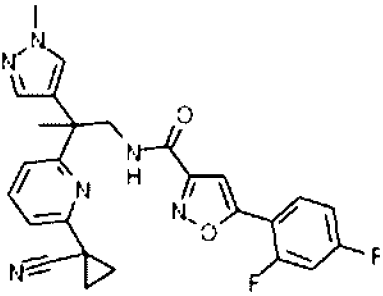
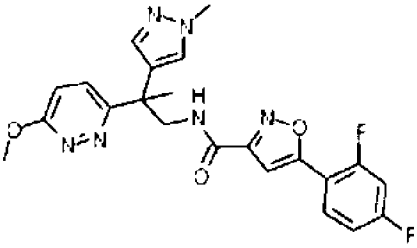
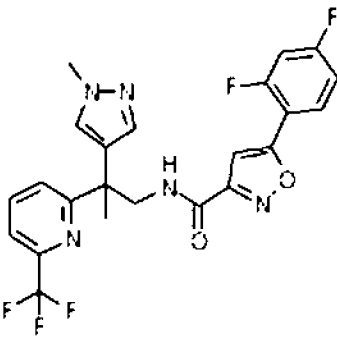
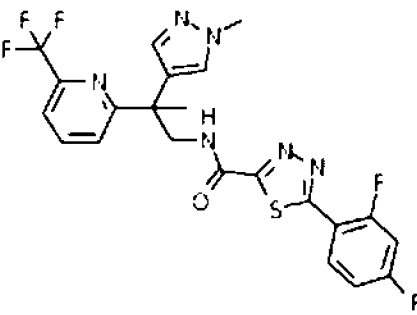
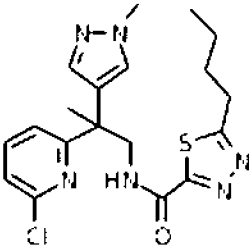
P-83	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,2,4-噁二唑-3-甲醯胺		1.49	459	安捷倫	
P-84	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-3-(2,4-二氟苯基)-1,2,4-噁二唑-5-甲醯胺		1.53	459	安捷倫	
P-85	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,5-二甲基吡唑-3-基)異噁唑-3-甲醯胺		1.42	440	安捷倫	182 - 184
P-86	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[6-(2-甲氧基嘧啶-5-基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.54	532	HSS	

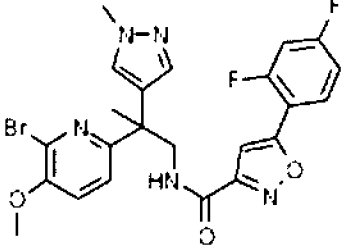
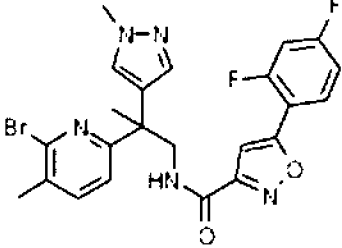
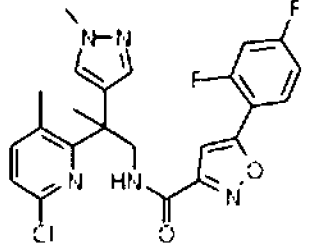
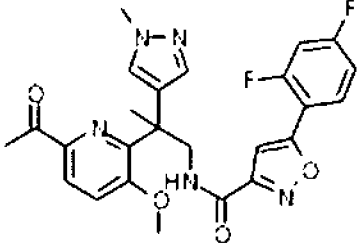
P-87	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[6-(2,6-二甲基-3-吡啶基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.08	529	HSS	
P-88	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[6-(2,4-二甲氧基嘍啶-5-基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.65	562	HSS	
P-89	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(1-甲基吡唑-4-基)-2-[6-(2-甲基-4-吡啶基)-2-吡啶基]丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.11	515	HSS	
P-90	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[6-(2,5-二甲基-3-吡啶基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.14	529	HSS	
P-91	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(1-甲基吡唑-4-基)-2-[6-(5-甲基-3-吡啶基)-2-吡		1.32	515	HSS	

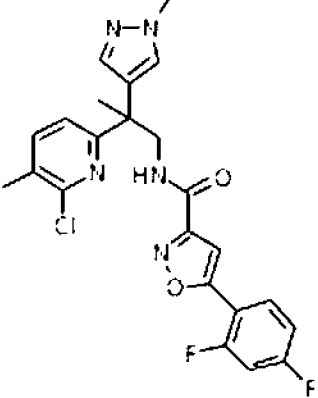
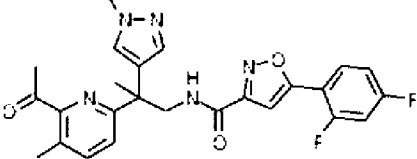
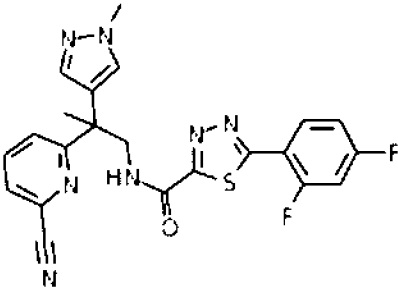
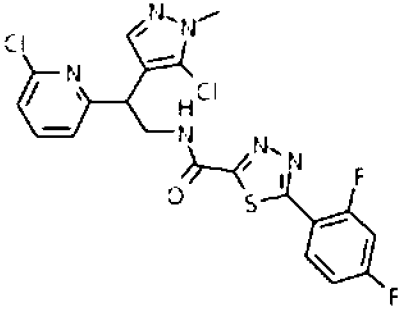
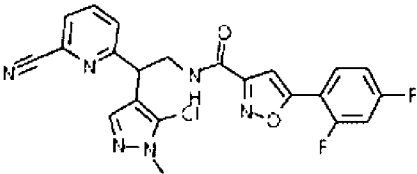
	啉基]丙基]異 噁唑-3-甲醯胺					
P-92	5-(2,4-二氟苯 基)-N-[2-[6- (4,5-二甲基-3- 吡啶基)-2-吡 啶基]-2-(1-甲 基吡唑-4-基) 丙基]異噁唑- 3-甲醯胺		1.18	529	HSS	
P-93	N-[2-[6-(2-氰 基-4-吡啶基)- 2-吡啶基]-2- (1-甲基吡唑-4- 基)丙基]-5- (2,4-二氟苯基) 異噁唑-3-甲醯 胺		1.59	526	HSS	
P-94	5-(2,4-二氟苯 基)-N-[2-[6- (3,5-二甲基異 噁唑-4-基)-2- 吡啶基]-2-(1- 甲基吡唑-4- 基)丙基]異噁 唑-3-甲醯胺		1.6	519	HSS	
P-95	5-(2,4-二氟苯 基)-N-[2-(1-甲 基吡唑-4-基)- 2-[6-(2-甲基吡 唑-3-基)-2-吡 啶基]丙基]異 噁唑-3-甲醯胺		1.5	504	HSS	

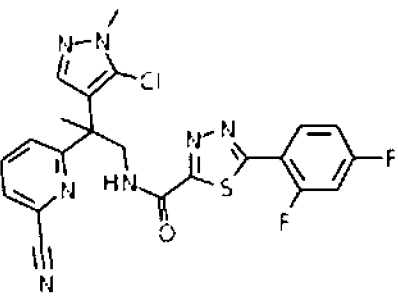
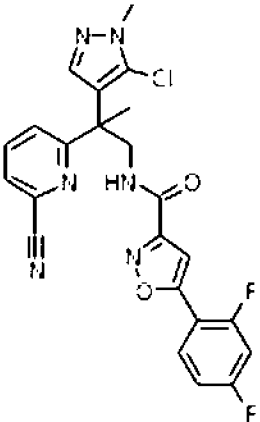
P-96	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[6-(5,6-二甲基-3-吡啶基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.18	529	HSS	
P-97	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[6-(5-氟-6-甲基-3-吡啶基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.67	533	HSS	
P-98	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[6-(2-氟-3-甲基-4-吡啶基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.67	533	HSS	
P-99	5-(4-氟-2-甲氧基-苯基)-N-[2-(6-甲氧基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.10	466	A	

P-100	5-(2-氟-4-甲氧基-苯基)-N-[2-(6-甲氧基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.08	466	A	
P-101	N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噁二唑-2-甲醯胺		3.07	459	SQ D	
P-102	N-[2-(6-環丙基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.12	464	A	
P-103	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-[6-(異丙基胺基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.31	480	HSS	

P-104	N-[2-[6-(1-氰基環丙基)-2-吡啶基]-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.05	489	A	
P-105	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(6-甲氧基嘧啶-3-基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]異噁唑-3-甲醯胺		0.95	455	A	
P-106	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(1-甲基吡啶-4-基)-2-[6-(三氟甲基)-2-吡啶基]丙基]異噁唑-3-甲醯胺		1.09	492	A	160 - 165
P-107	5-(2,4-二氟苯基)-N-[2-(1-甲基吡啶-4-基)-2-[6-(三氟甲基)-2-吡啶基]丙基]-1,3,4-噻二唑-2-甲醯胺		1.10	509	A	162 - 163
P-108	5-丁基-N-[2-(6-氯-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡啶-4-基)丙基]-1,3,4-噻二唑-2-甲醯胺		1.15	419	QD A	

P-109	N-[2-(6-溴-5-甲氧基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.10	532	A	
P-110	N-[2-(6-溴-5-甲基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.13	518	A	
P-111	N-[2-(6-氯-3-甲基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.13	472	A	
P-112	N-[2-(6-乙醯基-3-甲氧基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.02	497	A	

P-113	N-[2-(6-氯-5-甲基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.12	472	A	
P-114	N-[2-(6-乙醯基-5-甲基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.07	481	A	
P-115	N-[2-(6-氰基-2-吡啶基)-2-(1-甲基吡唑-4-基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噻二唑-2-甲醯胺		0.99	466	A	169 - 170
P-116	N-[2-(5-氯-1-甲基-吡唑-4-基)-2-(6-氯-2-吡啶基)乙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噻二唑-2-甲醯胺		1.08	495	A	150 - 151
P-117	N-[2-(5-氯-1-甲基-吡唑-4-基)-2-(6-氰基-2-吡啶基)乙基]-5-(2,4-二		1.00	469	A	

	氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺					
P-118	N-[2-(5-氯-1-甲基-吡唑-4-基)-2-(6-氰基-2-吡啶基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)-1,3,4-噻二唑-2-甲醯胺		1.06	500	A	
P-119	N-[2-(5-氯-1-甲基-吡唑-4-基)-2-(6-氰基-2-吡啶基)丙基]-5-(2,4-二氟苯基)異噁唑-3-甲醯胺		1.05	483	A	

生物學實施例

實施例B1：茄鏈格孢菌（*Alternaria solani*）/番茄/葉圓片（早枯病（early blight））

【0309】 將番茄葉圓片 cv.Baby 置於多孔盤（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下培育接種的葉圓片，並且化合物的活性被評估為在未經處理的檢驗葉圓片上出現適當水平的疾病損害時（施用後5-7天）與未經處理者相比的疾病控制百分比。當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時，以下化合物在200 ppm對茄鏈格孢菌給出至少80%的控制：

P-4、P-5、P-6、P-7、P-9、P-10、P-11、P-15、P-19、P-22、P-23、P-24、P-25、P-26、P-29、P-30、P-31、P-32、P-34、P-35、P-42、P-43、P-44、P-48、P-49、P-61、P-64、P-73、P-75、P-80、P-82、P-83、P-84、P-101、P-105、P-106、P-107、和P-110。

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)

【0310】 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) 溶液置於微量滴定盤 (96 孔規格) 中之後, 添加含有真菌孢子的營養培養液。將測試盤在24°C下進行培育並且在施用後3-4天藉由光度法確定對生長的抑制。當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時, 以下化合物在20 ppm下對灰葡萄孢菌給出至少80%的控制: P-1、P-2、P-4、P-5、P-6、P-9、P-10、P-11、P-13、P-15、P-16、P-19、P-21、P-24、P-25、P-26、P-29、P-30、P-31、P-32、P-34、P-35、P-36、P-38、P-39、P-41、P-42、P-43、P-46、P-47、P-48、P-49、P-50、P-55、P-64、P-68、P-69、P-73、P-80、P-81、P-82、P-83、P-84、P-88、P-101、P-102、P-106、P-107、P-108、P-110、P-115、P-116、P-117、P-118、和P-119

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)

【0311】 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) 溶液置於微量滴定盤 (96 孔規格) 中之後, 添加含有真菌孢子的營養培養液。將測試盤在24°C下進行培育並且在施用後3-4天藉由光度法測量對生長的抑制。當與在相同條件下顯示出廣

泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時，以下化合物在20 ppm下對瓜小叢殼菌給出至少80%的控制：

P-4、P-5、P-6、P-7、P-9、P-10、P-11、P-15、P-16、P-17、P-19、P-20、P-24、P-25、P-26、P-28、P-29、P-30、P-31、P-33、P-34、P-35、P-36、P-39、P-42、P-43、P-46、P-48、P-49、P-50、P-55、P-57、P-61、P-64、P-68、P-69、P-73、P-79、P-80、P-81、P-82、P-83、P-84、P-85、P-101、P-102、P-106、P-107、P-108、P-110、P-115、P-116、P-117、P-118、和P-119

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)

【0312】 將小麥葉段栽培品種坎斯勒 (cv. Kanzler) 置於多孔盤 (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，藉由在測試盤之上搖動感染白粉病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下培育接種的葉圓片，並且化合物的活性被評估為在未經處理的對照葉段上出現適當水平的疾病損害時 (施用後6-8天) 與未經處理者相比的疾病控制百分比。當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時，以下化合物在200 ppm下對小麥白粉病菌給出至少80%的控制：

P-4、P-5、P-6、P-8、P-9、P-10、P-11、P-15、P-16、P-19、P-21、P-24、P-25、P-26、P-29、P-30、P-31、P-34、P-35、P-36、P-42、P-43、P-49、P-59、P-64、P-69、P-73、P-82、P-83、P-84、P-85、P-101、P-107、和P-110

實施例B5：黃色镰刀菌 (*Fusarium culmorum*) /液體培養 (赤黴病 (Head blight))

【0313】 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) 溶液置於微量滴定盤 (96 孔規格) 中之後, 添加含有真菌孢子的營養培養液。將測試盤在24°C下進行培育並且在施用後3-4天藉由光度法確定對生長的抑制。當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時, 以下化合物在20 ppm下給出對黃色鐮刀菌的至少80%的控制:

P-4、P-5、P-9、P-10、P-15、P-16、P-24、P-25、P-26、P-29、P-30、P-31、P-34、P-35、P-36、P-42、P-43、P-46、P-49、P-73、P-80、P-82、P-83、P-84、P-102、P-106、P-107、P-108、P-110、P-115、P-116、P-118、P-119

實施例B6：黃色鐮刀菌/小麥/小穗預防性 (赤黴病)

【0314】 將小麥小穗栽培品種Monsoon置於多孔盤 (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, 用真菌的孢子懸浮液對小穗進行接種。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, 將接種的小穗在20°C和60%相對濕度下進行培育, 並且在未經處理的比較小穗上出現適當水平的疾病損害時 (施用後6-8天), 作為與未經處理者相比時的疾病控制百分比來評估化合物的活性。當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時, 以下化合物在200 ppm對黃色鐮刀菌給出至少80%的控制:

P-4、P-5、P-10、P-16、P-29、P-31、P-34、P-35、P-36、P-42、P-46、P-49、和 P-73

實施例B7：玉米赤黴 (黃色鐮刀菌 (*Fusarium graminearum*)) /小麥/小穗預防性 (赤黴病)

【0315】 將小麥小穗栽培品種Monsoon置於多孔盤 (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。施用後一天，將小穗用真菌的孢子懸浮液接種。在人工氣候室中在72 h半黑暗隨後是的12 h光照/12 h黑暗的一個光方案下，在20°C和60% rh培養接種的測試葉圓片，在未經處理的對照小穗上出現適當水平的疾病損害時（施用後6-8天），作為與未經處理者相比時的疾病控制百分比來評估化合物的活性。當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時，以下化合物在200 ppm對玉米赤黴給出至少80%的控制：P-4、P-5、P-9、P-16、P-24、P-26、P-30、P-35、P-36、P-42、P-46、P-73、P-80、和P-82

實施例B8：小麥穎枯病菌 (*Phaeosphaeria nodorum*) (穎枯殼針孢 (*Septoria nodorum*)) /小麥/葉圓片預防性 (穎斑枯病)

【0316】 將小麥葉段栽培品種坎斯勒 (cv. Kanzler) 置於多孔盤 (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下培育接種的測試葉圓片，並且化合物的活性被評估為在未經處理的檢驗葉圓片上出現適當水平的疾病損害時（施用後5-7天）與未經處理者相比的疾病控制百分比。當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時，以下化合物在200 ppm對穎枯殼針孢給出至少80%的控制：P-4、P-5、P-6、P-9、P-10、P-11、P-15、P-24、P-25、P-26、P-29、P-30、P-31、P-32、P-34、P-35、P-39、P-42、P-43、P-44、P-48、P-49、P-61、P-64、P-69、P-73、P-82、P-83、P-84、P-101、P-102、和P-110

實施例B9：雪腐明梭孢 (*Monographella nivalis*) (雪黴葉枯菌 (*Microdochium nivale*)) /液體培養 (穀類根腐病)

【0317】 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）溶液置於微量滴定盤（96孔規格）中之後，添加含有真菌孢子的營養培養液。將該等測試盤在24°C下進行培養並且施用之後4-5天藉由光度法測定對生長的抑制。當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時，以下化合物在20 ppm下對雪腐明梭孢給出至少80%的控制：

P-1、P-2、P-4、P-5、P-6、P-7、P-9、P-10、P-11、P-13、P-15、P-16、P-17、P-18、P-19、P-20、P-22、P-24、P-25、P-26、P-28、P-29、P-30、P-31、P-32、P-33、P-34、P-35、P-36、P-39、P-42、P-43、P-46、P-47、P-48、P-49、P-50、P-53、P-55、P-57、P-58、P-61、P-64、P-67、P-68、P-69、P-72、P-73、P-75、P-78、P-79、P-80、P-81、P-82、P-83、P-84、P-88、P-89、P-91、P-94、P-95、P-101、P-102、P-103、P-104、P-106、P-107、P-108、P-110、P-115、P-116、P-117、P-118、和P-119

實施例B10：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）

【0318】 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）溶液置於微量滴定盤（96孔規格）中之後，添加含有真菌孢子的營養培養液。將該等測試盤在24°C下進行培養並且施用之後4-5天藉由光度法測定對生長的抑制。當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時，以下化合物在20 ppm下對落花生球腔菌給出至少80%的控制：

P-4、P-5、P-9、P-10、P-15、P-16、P-17、P-24、P-25、P-26、P-29、P-30、P-31、P-34、P-35、P-36、P-42、P-43、P-46、P-48、P-49、P-50、P-61、P-68、P-69、

P-73、P-78、P-79、P-80、P-81、P-82、P-83、P-84、P-101、P-102、P-106、P-107、
P-108、P-110、P-115、P-116、P-117、P-118、和P-119

實施例B11：小麥隱匿柄鏽菌（*Puccinia recondita* f. sp. *tritici*）/小麥/葉圓片治療法（褐銹病）

【0319】 將小麥葉段栽培品種Kanzler置於多孔盤（24孔規格）內的瓊脂上。用真菌的孢子懸浮液接種該等葉碎片。在19°C和75% rh下，在黑暗中儲存板。在接種後1天，施用在水中稀釋的配製的測試化合物。在氣候室中，在12 h光照/12 h黑暗的光照方案下，在19°C和75% rh下培養葉段，並且在未經處理的對照葉段中出現適當水平的疾病損害時（施用後6-8天），作為與未經處理者相比的疾病控制百分比來評估化合物的活性。當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時，以下化合物在200 ppm下給出對小麥隱匿柄鏽菌至少80%的控制：

P-19

實施例B12：小麥隱匿柄鏽菌（*Puccinia recondita* f. sp. *tritici*）/小麥/葉圓片預防性（褐銹病）

【0320】 將小麥葉段栽培品種坎斯勒置於多孔盤（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，用真菌的孢子懸浮液接種該葉圓片。在氣候室中在12 h光照/12 h黑暗的光方案下，在19°C和75% rh下培育接種的葉段，並且化合物的活性被評估為在未經處理的檢驗葉段中出現適當水平的疾病損害時（施用後7-9天）與未經處理者相比的疾病控制百分比。當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時，以下化合物在200 ppm下給出對小麥隱匿柄鏽菌至少80%的控制：

P-10、P-20

實施例B13：稻瘟病菌 (*Magnaporthe grisea*) (*稻梨孢* (*Pyricularia oryzae*)) /稻/葉圓片預防性 (稻瘟病)

【0321】 將稻葉段栽培品種Ballila置於多孔盤 (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，用真菌的孢子懸浮液接種該葉段。在氣候箱中在24 h黑暗隨後是12 h光照/12 h黑暗的光方案下，在22°C和80% rh下培育接種的葉段，並且化合物的活性被評估為在未經處理的對照葉段上出現適當水平的疾病損害時 (施用後5-7天) 與未經處理者相比的疾病控制百分比。當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時，以下化合物在200 ppm下對稻瘟病菌給出至少80%的控制：

P-8、P-10、P-15、P-26、P-39、P-42、P-49、P-103、P-110

實施例B14：圓核腔菌 (*Pyrenophora teres*) /大麥/葉圓片預防性 (網斑病)

【0322】 將大麥葉段栽培品種Hasso置於多孔盤 (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天之後用真菌的孢子懸浮液接種該葉片段。在氣候箱中在12 h光照/12 h黑暗的光方案下，在20°C和65% rh下培育接種的葉段，並且化合物的活性被評估為在未經處理的對照葉段上出現適當水平的疾病損害時 (施用後5-7天) 與未經處理者相比的疾病控制。當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時，以下化合物在200 ppm對圓核腔菌給出至少80%的控制：

P-2、P-3、P-4、P-5、P-6、P-8、P-9、P-10、P-11、P-15、P-16、P-19、P-20、P-21、P-22、P-23、P-24、P-25、P-26、P-29、P-30、P-31、P-32、P-34、P-35、P-36、P-42、P-43、P-44、P-45、P-48、P-49、P-50、P-52、P-53、P-56、P-61、P-

63、P-64、P-69、P-73、P-75、P-79、P-80、P-82、P-83、P-84、P-85、P-101、P-102、P-105、P-107、P-110

實施例B15：核盤菌（*Sclerotinia sclerotiorum*）/液體培養（棉狀腐病）

【0323】 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）溶液置於微量滴定盤（96孔規格）中之後，添加含有真菌材料的營養培養液。將測試盤在24°C下進行培育並且在施用後3-4天藉由光度法確定對生長的抑制。當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時，以下化合物在20 ppm下對核盤菌給出至少80%的控制：

P-4、P-9、P-10、P-16、P-24、P-25、P-26、P-29、P-30、P-31、P-34、P-35、P-42、P-43、P-49、P-73、P-82、P-84、P-101、P-102、P-106、P-107、P-110、P-118、和P-119

實施例B16：禾生球腔菌（*Mycosphaerella graminicola*）（小麥殼針孢（*Septoria tritici*））/液體培養（葉枯病（*Septoria blotch*））

【0324】 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）溶液置於微量滴定盤（96孔規格）中之後，添加含有真菌孢子的營養培養液。將該等測試盤在24°C下進行培養並且施用之後4-5天藉由光度法測定對生長的抑制。當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病進展的未經處理的對照組相比時，以下化合物在20 ppm下對禾生球腔菌給出至少80%的控制：

P-1、P-2、P-4、P-5、P-6、P-7、P-9、P-10、P-11、P-13、P-14、P-15、P-16、P-17、P-18、P-19、P-20、P-21、P-24、P-25、P-26、P-28、P-29、P-30、P-31、P-

32、P-33、P-34、P-35、P-36、P-38、P-39、P-41、P-42、P-43、P-46、P-47、P-48、P-49、P-50、P-55、P-57、P-61、P-63、P-64、P-66、P-67、P-68、P-69、P-73、P-75、P-77、P-78、P-79、P-80、P-81、P-82、P-83、P-84、P-85、P-88、P-89、P-91、P-94、P-95、P-97、P-98、P-99、P-101、P-102、P-103、P-104、P-106、P-107、P-108、P-109、P-110、P-112、P-115、P-116、P-117、P-118、和P-119

【符號說明】

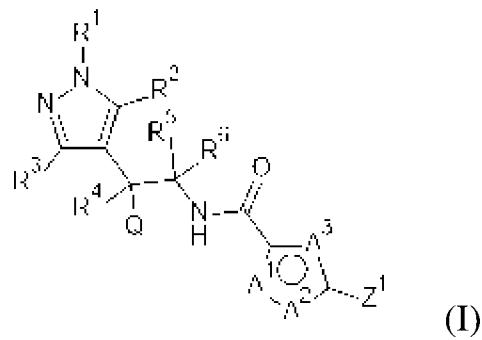
【0325】 無

【生物材料寄存】

【0326】 無

【發明申請專利範圍】

【請求項1】一種具有式 (I) 之化合物，



其中

R¹選自由以下者組成之群組：氫、C₁-C₄烷基、C₂-C₄烯基、C₂-C₄炔基和C₃-C₆環烷基；

R²選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄烷基、C₂-C₄烯基、C₂-C₄炔基、C₁-C₄鹵代烷基、C₃-C₆環烷基、C₁-C₄烷基羰基、N-C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄烷基-碳醯亞胺基、N-羥基-C₁-C₄烷基-碳醯亞胺基和C₁-C₄烷氧基羰基；

R³選自由以下者組成之群組：氫、鹵素和C₁-C₄烷基；

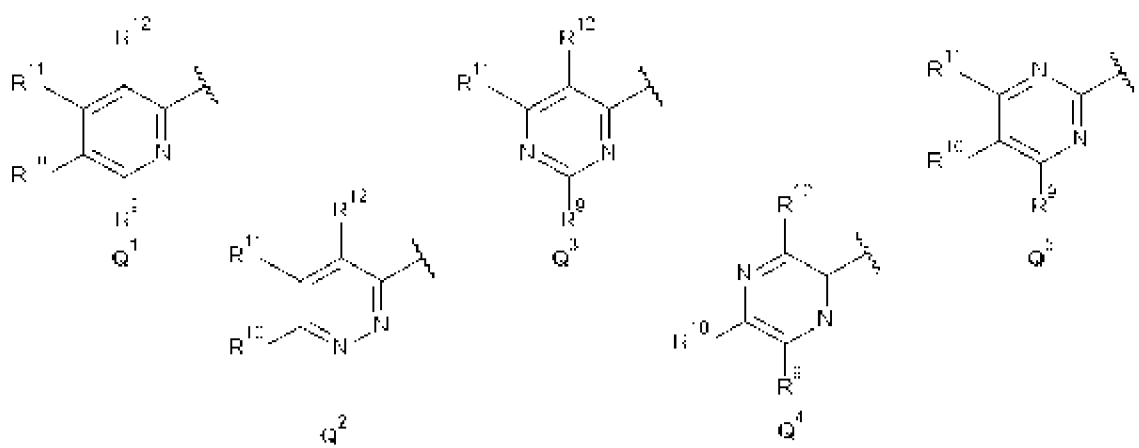
R⁴選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、C₁-C₄烷基、氰基、C₁-C₄烷基羰基、C₁-C₄烷氧基羰基、C₁-C₄烷基胺基羰基和二(C₁-C₄烷基胺基)羰基；

R⁵和R⁶獨立地選自由以下者組成之群組：氫和C₁-C₄烷基；

A¹、A²和A³獨立地選自由CR⁷、N、NR⁸、O和S組成之群組，其前提係A¹、A²和A³中的至少一者選自N、O和S，並且A¹、A²和A³中不超過一個係O或S；

R⁷和R⁸獨立地選自由以下者組成之群組：氫、C₁-C₄烷基、C₂-C₄烯基和C₂-C₄炔基；

Q 選自由以下者組成之群組：Q¹、Q²、Q³、Q⁴和Q⁵：



其中

R⁹、R¹⁰、R¹¹和R¹²獨立地選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、胺基、羥基、羧酸、氰基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵代烷氧基、C₂-C₄烯氧基、C₂-C₄炔氧基、C₁-C₄烷基氫硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基、C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄烷基、N-C₁₋₄烷基胺基、N,N-二C₁₋₄烷基胺基、C₁-C₆烷氧基羰基、C₁-C₄烷基羰基、N-C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄烷基-碳醯亞胺基、N-羥基-C₁-C₄烷基-碳醯亞胺基、C₁-C₄烷基胺基羰基、二(C₁-C₄烷基胺基)羰基、C₁-C₄烷基羰基胺基、C₁-C₄烷基磺醯基胺基、三氟甲基磺醯基氧基、苯基、5員或6員雜芳基和C₃-C₆環烷基，其中該5員或6員雜芳基包含1、2、3或4個單獨地選自N、O和S的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和C₃-C₆環烷基中的任一者視需要被1、2或3個獨立地選自鹵素、氰基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵代烷基和C₁-C₄烷氧基的取代基取代；並且

Z¹選自由以下者組成之群組：C₁-C₄烷基、苯基、5員或6員雜芳基和C₃-C₆環烷基，其中該5員或6員雜芳基包含1、2、3或4個單獨地選自N、O和S的雜原子，並且其中所述苯基、5員或6員雜芳基和C₃-C₆環烷基中的任一者視需要被1、2或3個獨立地選自鹵素、氰基、C₁-C₄烷基、C₁-C₄鹵代烷基、C₁-C₄烷氧基、C₁-C₄鹵代烷氧基、C₁-C₄烷基氫硫基、C₁-C₄烷基亞磺醯基、C₁-C₄烷基磺醯基和C₂-C₄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。

【請求項2】如請求項1之具有式 (I) 之化合物，其中 R^1 係甲基、乙基或異丙基。

【請求項3】如請求項1或請求項2之具有式 (I) 之化合物，其中 R^2 選自由以下者組成之群組：氫、氟、氯和甲基。

【請求項4】如請求項1或請求項2之具有式 (I) 之化合物，其中 R^3 選自由以下者組成之群組：氫、氟、氯和甲基。

【請求項5】如請求項1或請求項2之具有式 (I) 之化合物，其中 R^4 選自由以下者組成之群組：氫、甲基、乙基、異丙基和氰基。

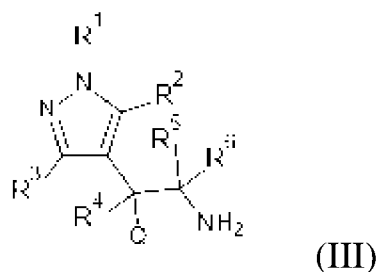
【請求項6】如請求項1或請求項2之具有式 (I) 之化合物，其中 R^5 和 R^6 獨立地選自由以下者組成之群組：氫、甲基和乙基。

【請求項7】如請求項1或請求項2之具有式 (I) 之化合物，其中Q選自由以下者組成之群組： Q^1 、 Q^2 和 Q^3 。

【請求項8】如請求項1或請求項2之具有式 (I) 之化合物，其中 R^9 和 R^{10} 獨立地選自由以下者組成之群組：氫、鹵素、胺基、羥基、羧酸、氰基、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_2 鹵代烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_3 鹵代烷氧基、 C_2 - C_3 烯氧基、 C_2 - C_3 炔氧基、 C_1 - C_2 烷基氫硫基、 C_1 - C_2 烷基亞磺基、 C_1 - C_2 烷基磺基、 C_1 - C_2 烷氧基- C_1 - C_2 烷基、N- C_{1-4} 烷基胺基、N,N-二- C_{1-4} 烷基胺基、 C_1 - C_3 烷氧基羰基、 C_1 - C_2 烷基羰基、N- C_1 - C_2 烷氧基- C_1 - C_2 烷基-碳基亞胺基、N-羥基- C_1 - C_2 烷基-碳基亞胺基、 C_1 - C_2 烷基胺基羰基、二(C_1 - C_2 烷基胺基)羰基、 C_1 - C_2 烷基羰基胺基、 C_1 - C_2 烷基磺基胺基、三氟甲基磺基氧基、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、3-氯吡咯-1-基、4-(三氟甲基)吡唑-1-基、3-(三氟甲基)吡唑-1-基、3-氰基吡唑-1-基、4-氰基吡唑-1-基、5-氯吡唑-1-

【請求項11】如請求項1或請求項2之具有式 (I) 之化合物，其中 Z^1 選自由以下者組成之群組：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、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、2-呋喃基、2-噻吩基、3-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、正丙基和苯基。

【請求項12】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對應於與對於如請求項1至8中任一項之具有式 (I) 之化合物相同的定義。

【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11中任一項所定義的具有式 (I) 之化合物。

【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11中任一項所定義的具有式 (I) 之化合物或包含該具有式 (I) 之化合物的組成物施用至該等植物、其部分或其場所。

【請求項15】一種如請求項1至11中任一項之化合物之用途，其用於作為殺真菌劑。