



(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 202102492 A

(43)公開日：中華民國 110 (2021) 年 01 月 16 日

(21)申請案號：109108227

(22)申請日：中華民國 109 (2020) 年 03 月 12 日

(51)Int. Cl.：

C07D413/14 (2006.01)

C07D417/14 (2006.01)

A01N43/78 (2006.01)

A01N43/824 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

(30)優先權：2019/03/15 日本

JP2019-048196

(71)申請人：日商日本曹達股份有限公司(日本) NIPPON SODA CO., LTD. (JP)

日本

(72)發明人：幸堀伸哉 KOUBORI, SHINYA (JP)；伊藤衆一 ITO, SYUICHI (JP)；玉伊徹生 TAMAI, TETSUO (JP)；小山裕明 KOYAMA, HIROAKI (JP)；川崎達弘 KAWASAKI, TATSUHIRO (JP)；藤井孝行 FUJII, TAKAYUKI (JP)；西野茂樹 NISHINO, SHIGEKI (JP)；渡辺慎也 WATANABE, SHINYA (JP)；加藤英樹 KATO, HIDEKI (JP)；國嶋幹子 KUNISHIMA, MIKIKO (JP)；植^薄信也 UESUSUKI, SHINYA (JP)；野村珠里 NOMURA, JURI (JP)；佐野^博 SANO, HIROSHI (JP)；齋賀睦幸 SAIGA, TOMOYUKI (JP)

(74)代理人：閻啓泰；林景郁

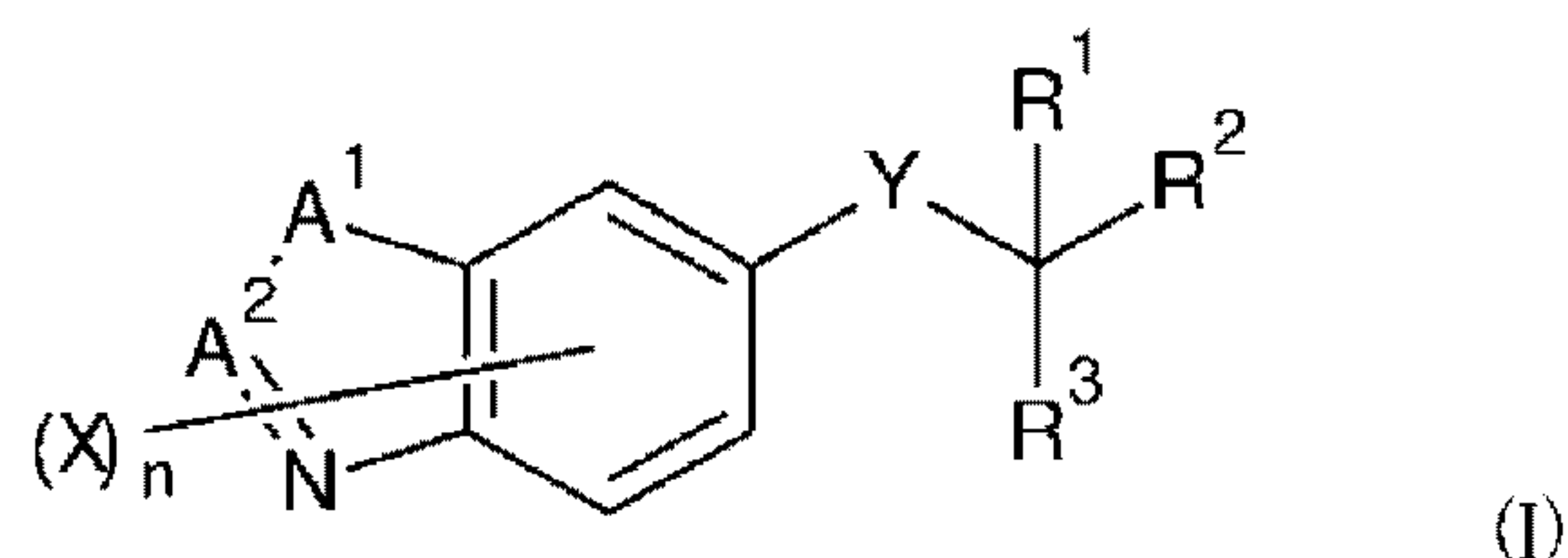
申請實體審查：無 申請專利範圍項數：5 項 圖式數：0 共 103 頁

(54)名稱

雜環化合物及農園藝用殺菌劑

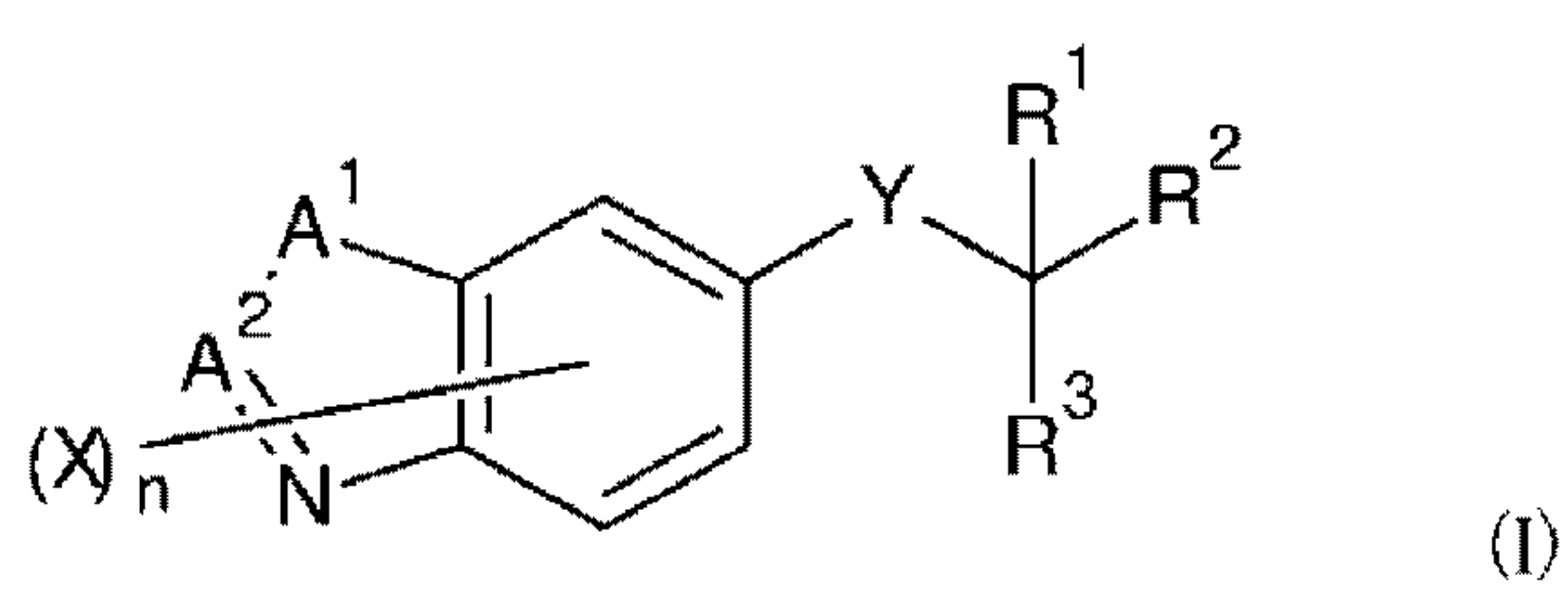
(57)摘要

提供一種式(I) (式(I)中， R^1 為經取代或未經取代之C1-6烷基等， R^2 為經取代或未經取代之5~6員雜芳基， R^3 為經取代或未經取代之C1-6烷基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基羰基等，Y為氧原子或NH， A^1 為硫原子、氧原子或 NR^4 ， R^4 為C1-6烷基， A^2 為碳原子或氮原子，X為取代基，n表示化學上容許之X之個數且為0~3之任意整數，並且於n為2以上時，X可相互相同亦可不同)所表示之化合物或其鹽。



無

特徵化學式：





202102492

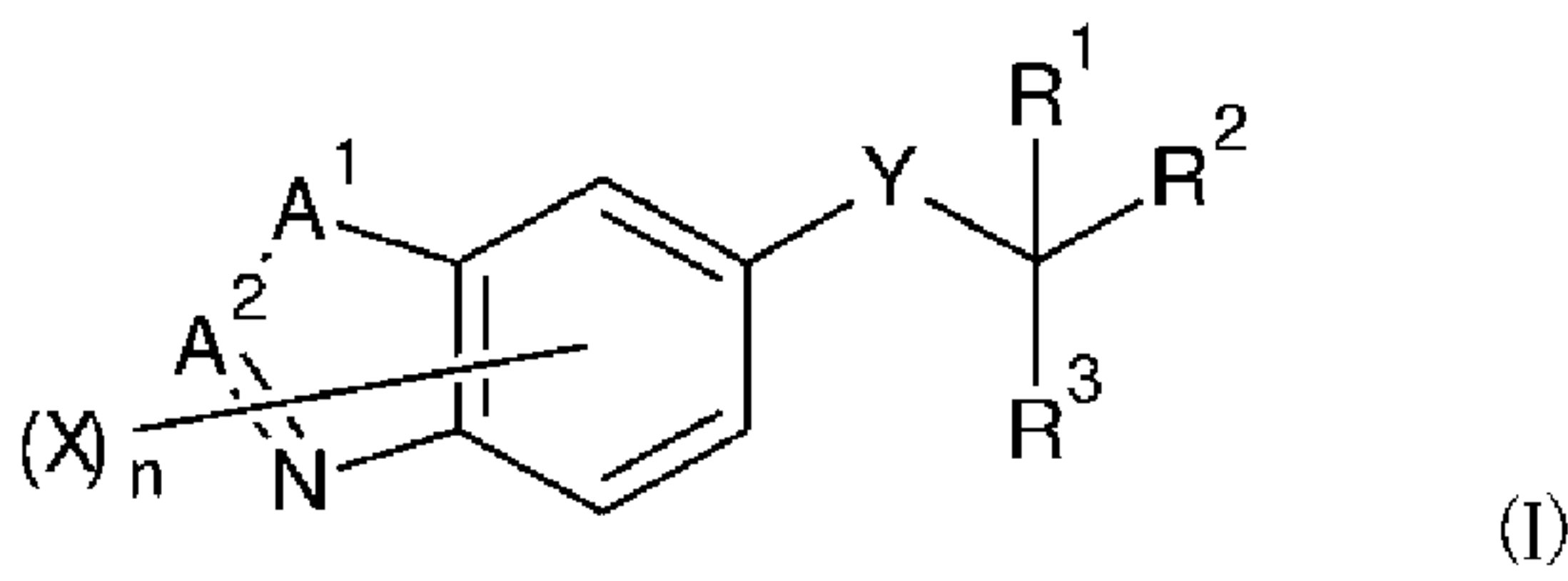
【發明摘要】

【中文發明名稱】 雜環化合物及農園藝用殺菌劑

【英文發明名稱】 無

【中文】

提供一種式 (I) (式 (I) 中， R^1 為經取代或未經取代之 C1-6 烷基等， R^2 為經取代或未經取代之 5~6 員雜芳基， R^3 為經取代或未經取代之 C1-6 烷基、經取代或未經取代之 C1-6 烷氧基羰基等，Y 為氧原子或 NH， A^1 為硫原子、氧原子或 NR^4 ， R^4 為 C1-6 烷基， A^2 為碳原子或氮原子，X 為取代基，n 表示化學上容許之 X 之個數且為 0~3 之任意整數，並且於 n 為 2 以上時，X 可相互相同亦可不同) 所表示之化合物或其鹽。



【英文】

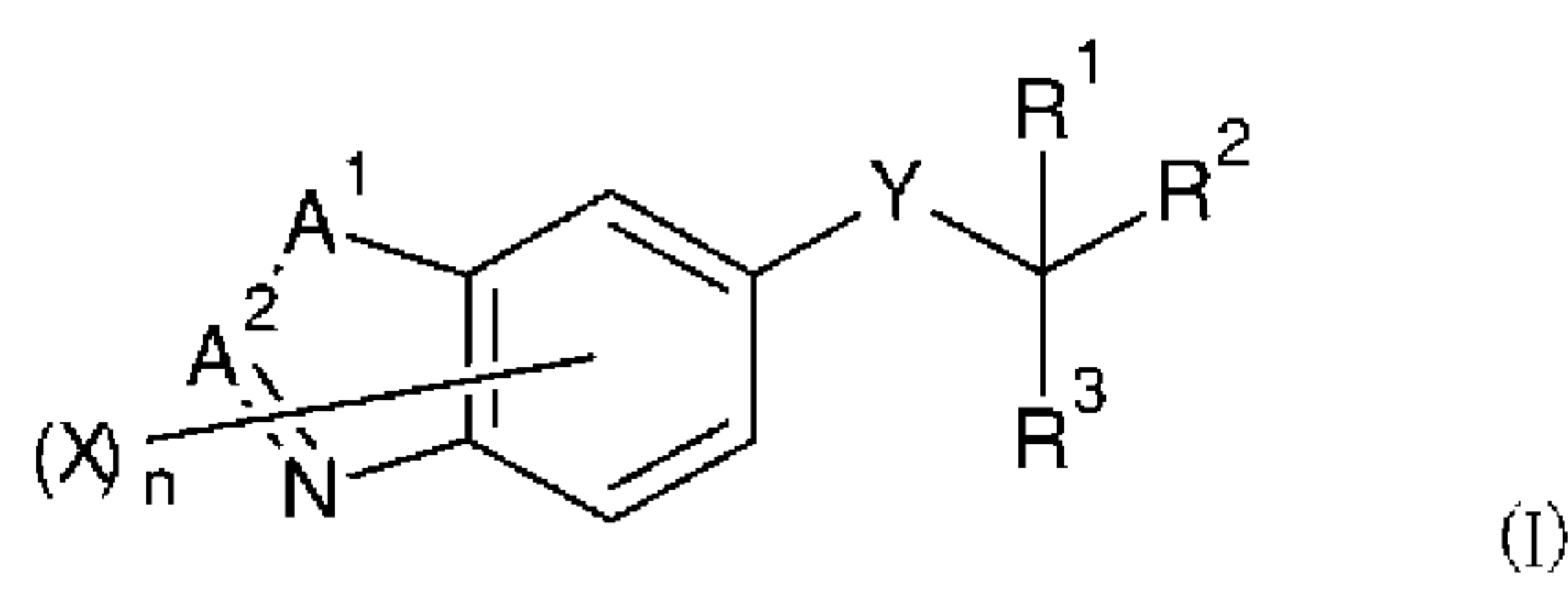
無

【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】 雜環化合物及農園藝用殺菌劑

【英文發明名稱】 無

【技術領域】

【0001】 本發明係關於一種雜環化合物及農園藝用殺菌劑。更詳細而言，本發明係關於一種殺菌活性優異、安全性優異、且能夠於工業上有利地合成之雜環化合物，以及含有該雜環化合物作為有效成分之農園藝用殺菌劑。

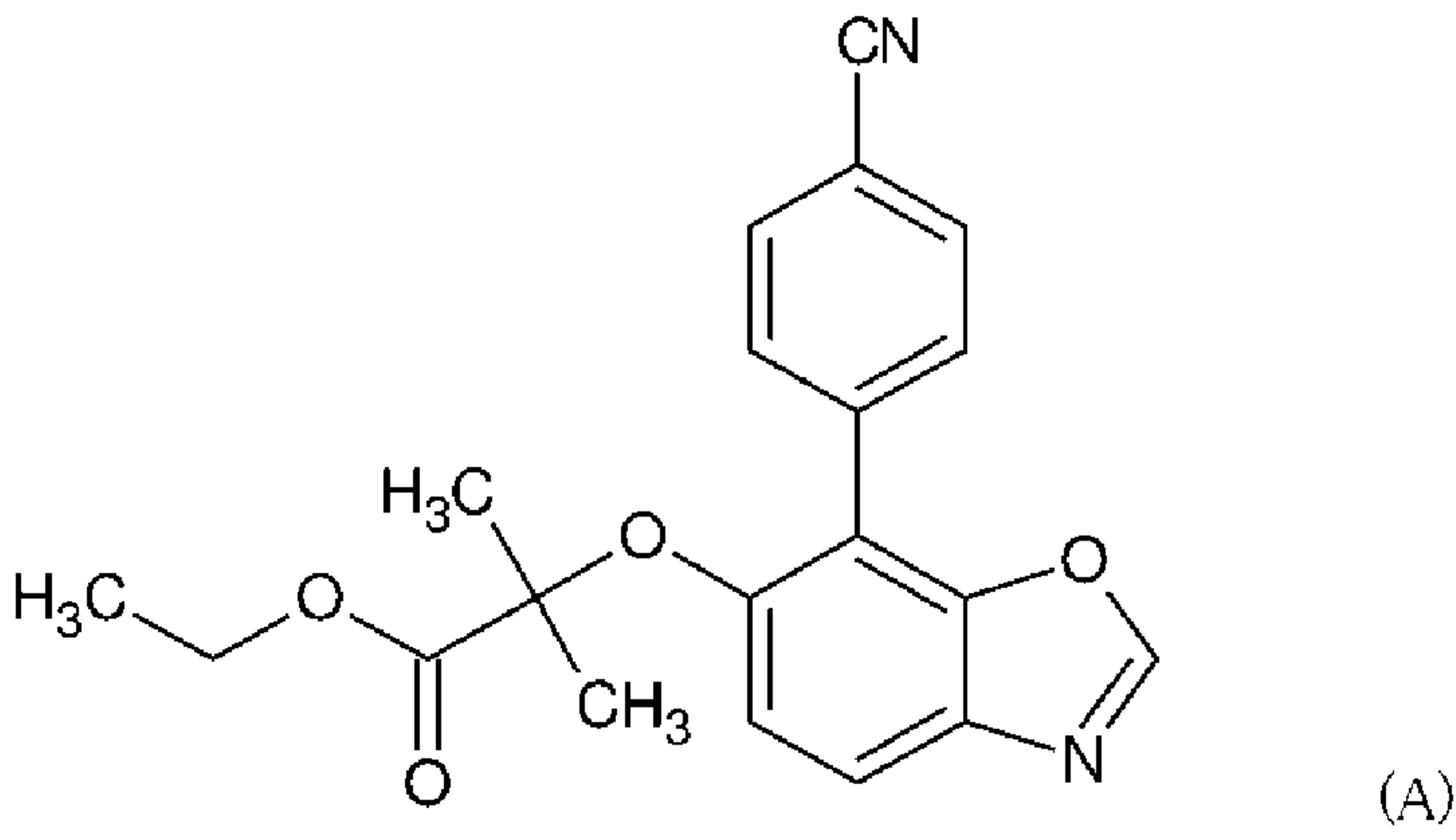
本申請基於2019年3月15日於日本提出申請之特願2019-048196號主張優先權，並將其內容引用於本申請。

【先前技術】

【0002】 於農園藝作物之栽培中，對於作物病害提出了多種防除藥劑。所提出之大部分防除藥劑，其防除效果並不充分，或者由於抗藥性病原菌之出現而使其用途受到限制，或者對植物體產生藥害或污染，或者對人畜魚類之毒性或對環境之影響較大等，不能充分令人滿意。因此，強烈希望此種缺點少、能夠安全使用之防除藥劑之出現。

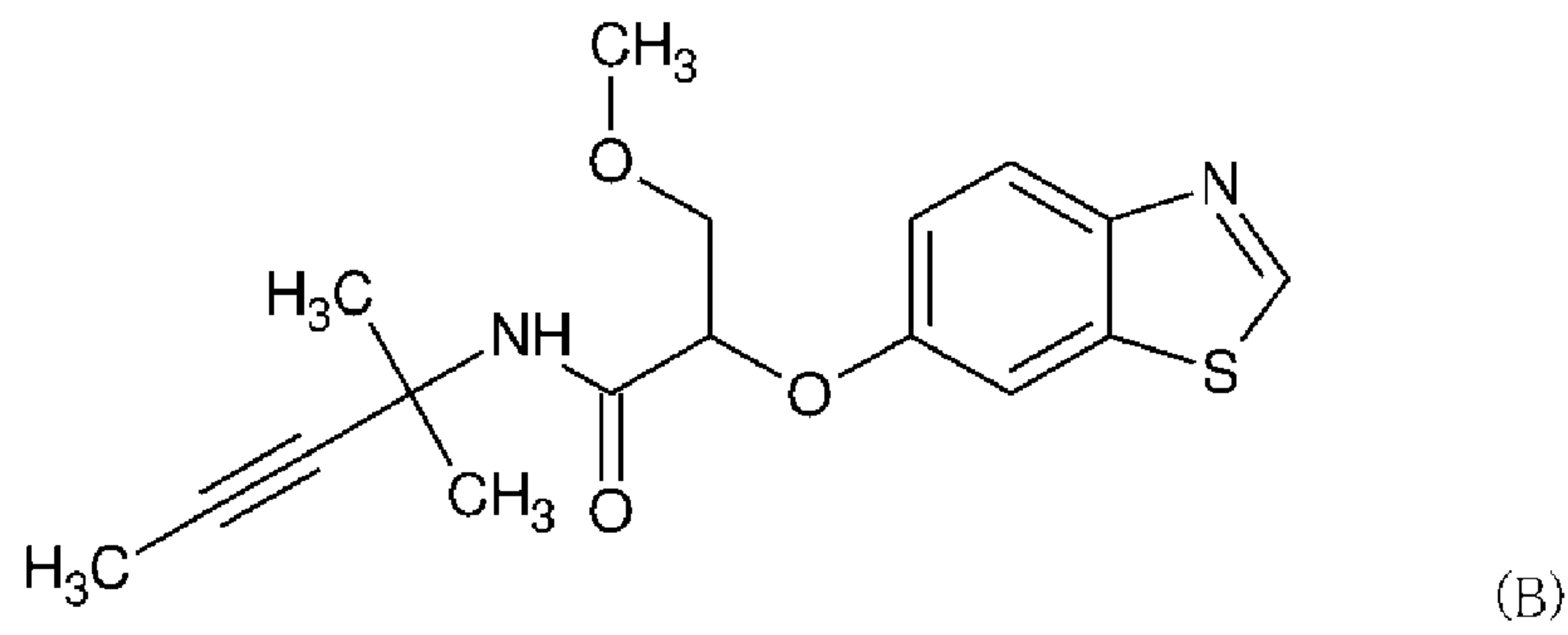
【0003】 其中，於專利文獻1中公開了式（A）所表示之化合物等。

【0004】



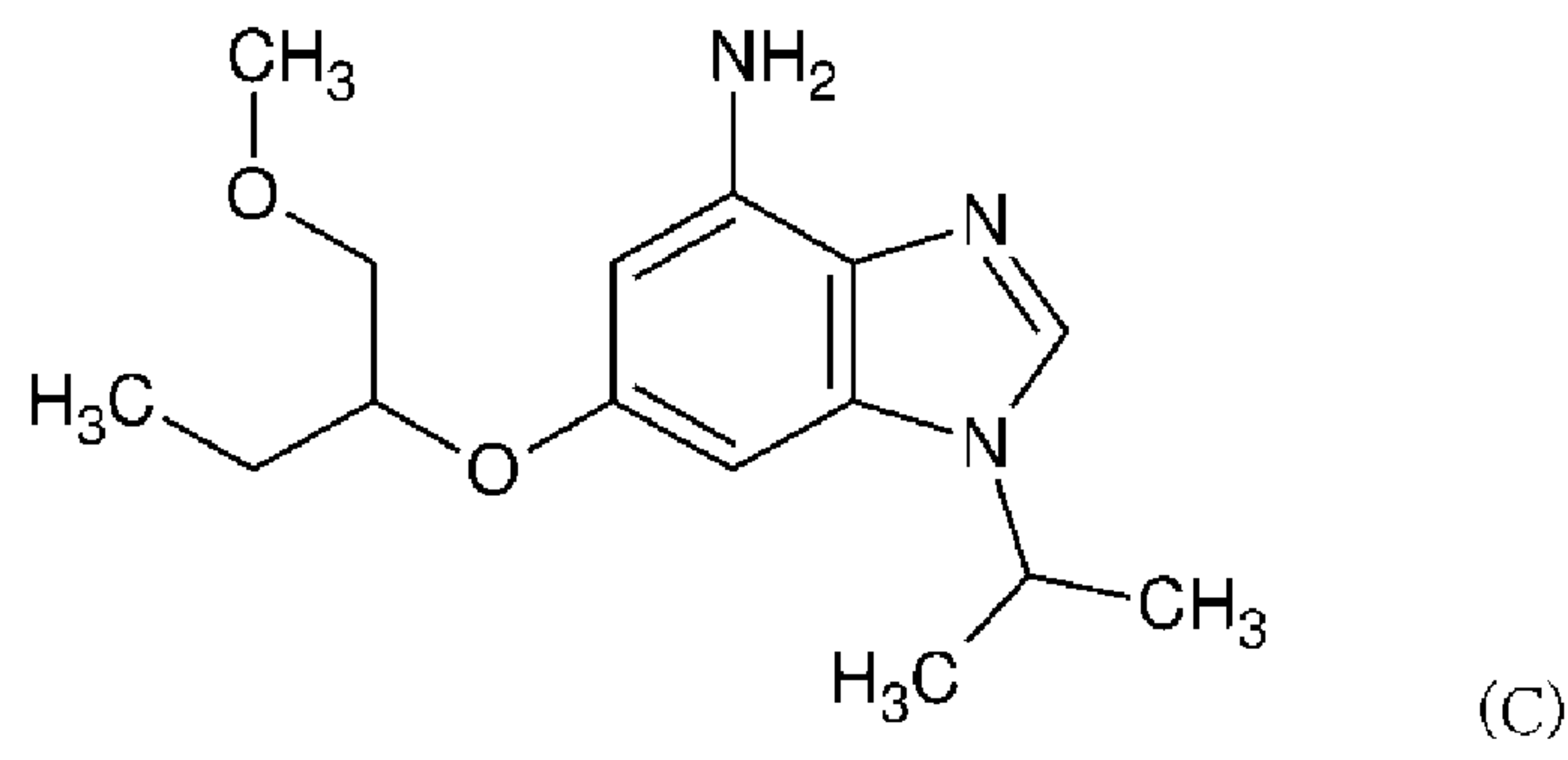
【0005】 於專利文獻2中公開了式（B）所表示之化合物等。

【0006】



【0007】 又，於非專利文獻1中公開了式（C）所表示之化合物等。

【0008】



[先前技術文獻]

[專利文獻]

【0009】

[專利文獻1]WO2016/108282A

[專利文獻2]WO2004/108964A

[非專利文獻]

【0010】 [非專利文獻1]Bioorganic & Medicinal Chemistry, Volume: 19, Issue: 1, Pages: 359-373.

【發明內容】

[發明所欲解決之課題]

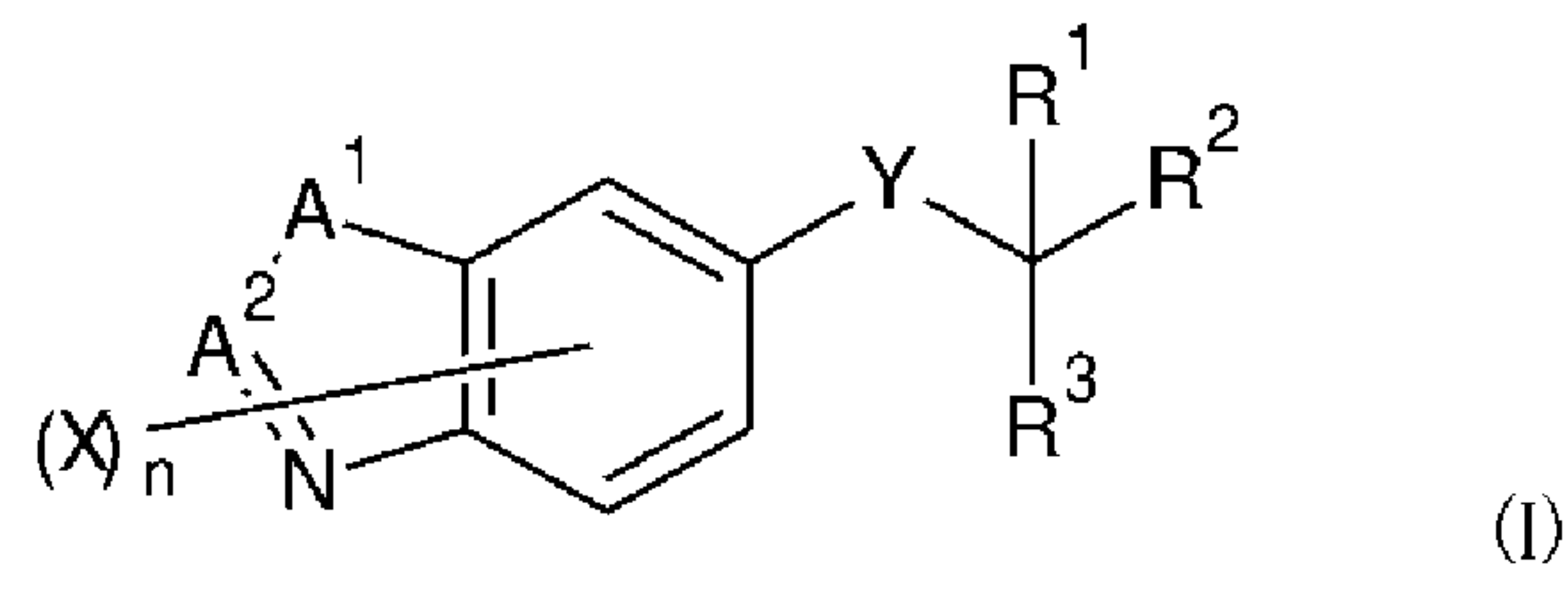
【0011】 本發明之課題在於提供一種殺菌活性優異、安全性優異、且能夠於工業上有利地合成之雜環化合物，以及含有該雜環化合物作為有效成分之農園藝用殺菌劑。

[解決課題之技術手段]

【0012】 為了解決上述課題而進行了深入研究，結果完成了包含以下形態之本發明。

【0013】 [1] 一種式 (I) 所表示之化合物或其鹽：

【0014】



【0015】 (式 (I) 中，

R¹為氫原子、經取代或未經取代之C1-6烷基、或鹵素基，

R²為經取代或未經取代之5~6員雜芳基，

R³為經取代或未經取代之C1-6烷基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基羰基、經取代或未經取代之C1-6烷硫基 (alkylthio)、經取代或未經取代之C6-10芳基、經取代或未經取代之5~6員雜芳基、式：「-C(Rⁱ)=NOR^j」所表示之基或式：「-C(=O)NHR^s」所表示之基，

Rⁱ為氫原子或C1-6烷基，

R^j為經取代或未經取代之C1-6烷基，

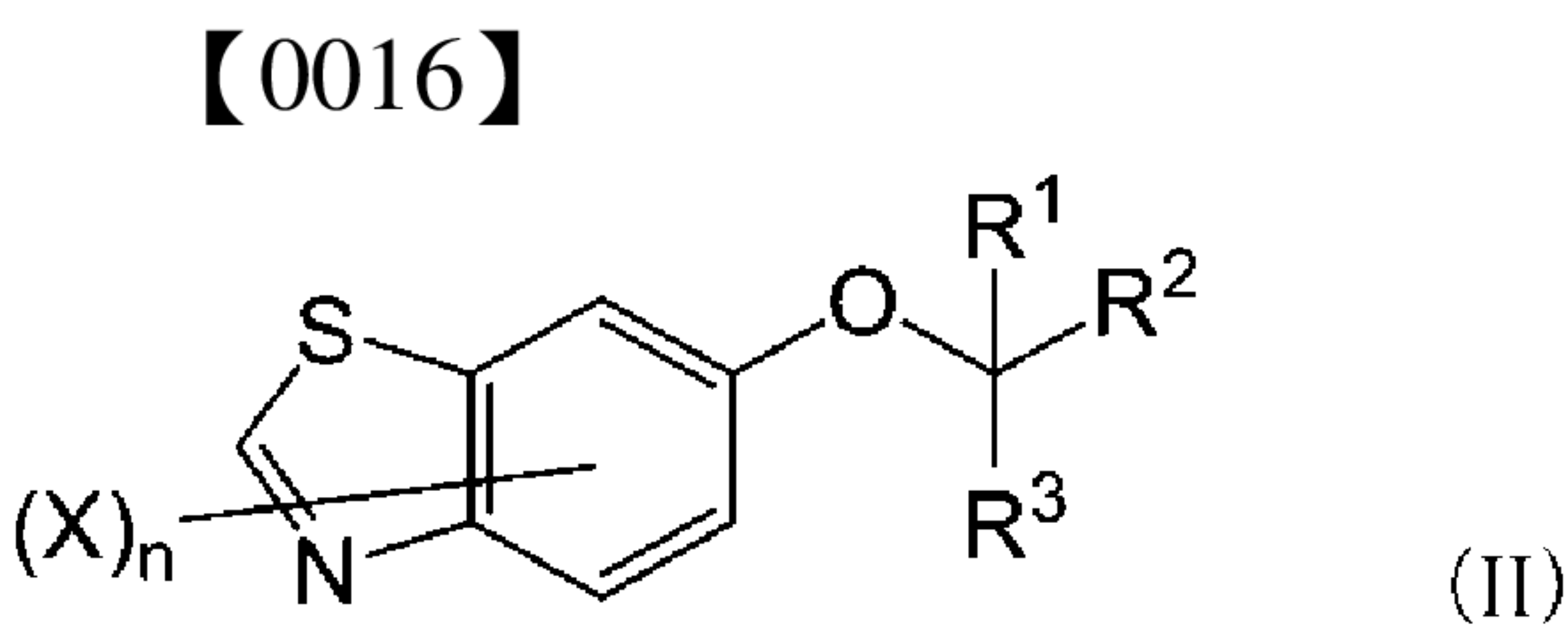
R^s為經取代或未經取代之C1-6烷基，

Y為氧原子或NH，

A¹為硫原子、氧原子或NR⁴，
R⁴為C1-6烷基，
A²為碳原子、或氮原子，
X為取代基，
n表示化學上容許之X之個數，且為0~3之任意整數，且
於n為2以上時，X可相互相同亦可不同）。

[2] 如上述[1]所述之化合物或其鹽，其中，於式（I）中，X為經取代或未經取代之C1-6烷基、經取代或未經取代之C2-6烯基、經取代或未經取代之C2-6炔基、羥基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基羰基、經取代或未經取代之C1-6烷硫基、經取代或未經取代之C3-8環烷基、經取代或未經取代之C6-10芳基、鹵素基、氰基、式：「-NR^aR^b」所表示之基（式中，R^a及R^b各自獨立地為氫原子、C1-6烷基、或C1-6烷氧基羰基）、或式：「-C(R^e)=NOR^f」所表示之基（式中，R^e及R^f各自獨立地為氫原子、或C1-6烷基）。

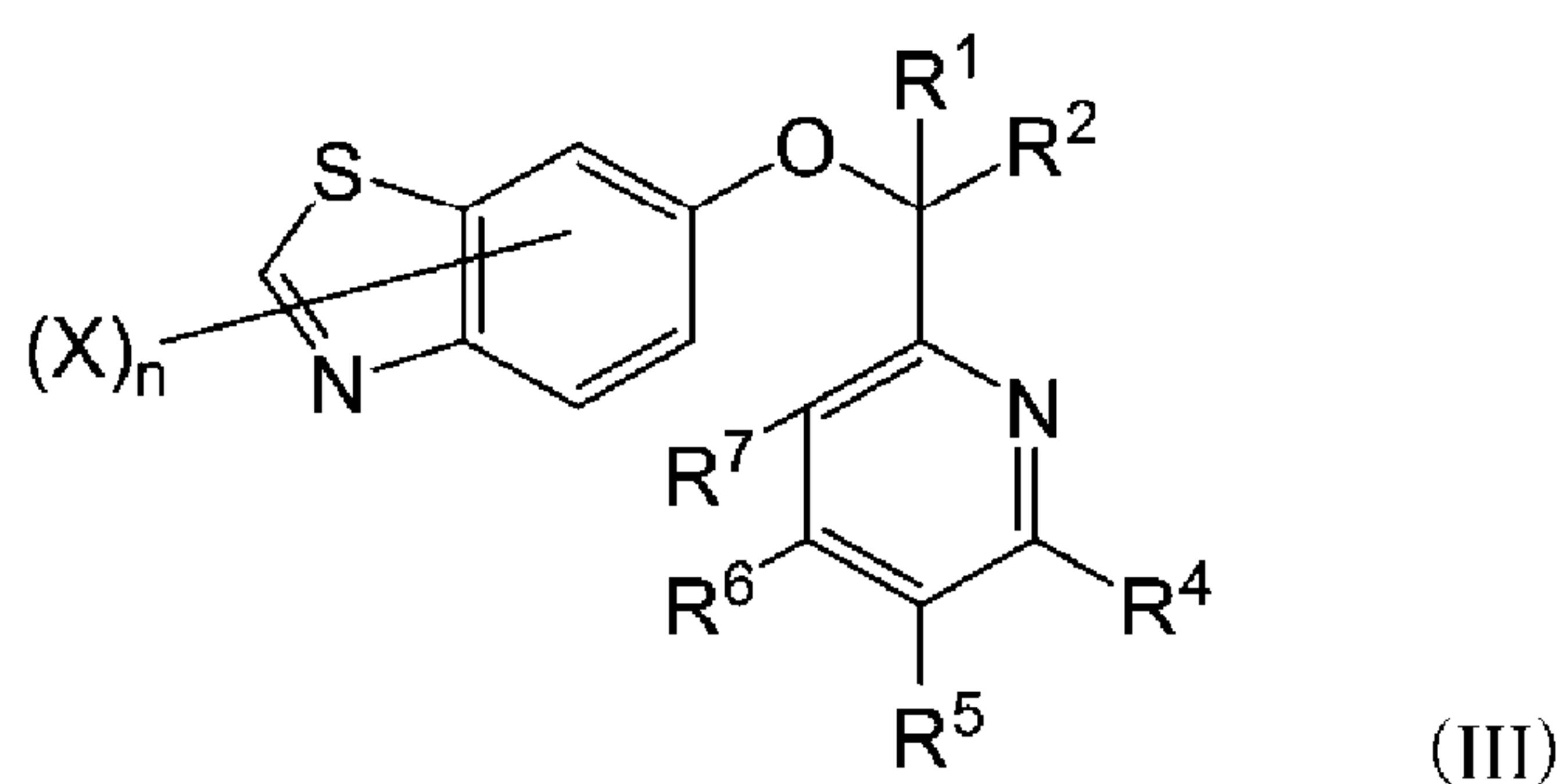
[3] 如上述[1]所述之化合物或其鹽，其中式（I）為式（II）：



【0017】 式（II）中，R¹、R²、R³、X及n表示與式（I）中之該等相同之含義。

[4] 如上述[1]所述之化合物或其鹽，其中式（I）為式（III）：

【0018】



【0019】 式（III）中，

R^1 、 R^2 、X及n表示與式（I）中之該等相同之含義，

R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 各自獨立地為氫原子、經取代或未經取代之C1-6烷基、經取代或未經取代之C2-6烯基、經取代或未經取代之C2-6炔基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基羰基、經取代或未經取代之C1-6烷硫基、經取代或未經取代之C1-6烷基亞磺醯基、經取代或未經取代之C1-6烷基磺醯基、經取代或未經取代之C6-10芳基、經取代或未經取代之5~6員雜環基、鹵素基、氰基、硝基、式：「 $-C(R^g)=NOR^h$ 」（式中， R^g 為氫原子、C1-6烷基或胺基， R^h 為氫原子、經取代或未經取代之C1-6烷基、或C2-6炔基）所表示之基、式：「 $-O-N=CR^cR^d$ 」（式中， R^c 及 R^d 各自獨立地為氫原子、或C1-6烷基）所表示之基、或式：「 $-C(=O)NR^pR^q$ 」（ R^p 及 R^q 各自獨立地為氫原子或C1-6烷基）。

[5] 一種農園藝用殺菌劑，其含有選自由上述[1]~[4]中所述之化合物及該等之鹽所組成之群之至少一種作為有效成分。

[發明之效果]

【0020】 本發明之雜環化合物及其鹽之殺菌活性優異，效果可靠，安全性優異，且能夠於工業上有利地合成。本發明之農園藝用殺菌劑具有優異之防除效果，對植物體不產生藥害，對人畜魚類之毒性或對環境之影響小。

【圖式簡單說明】

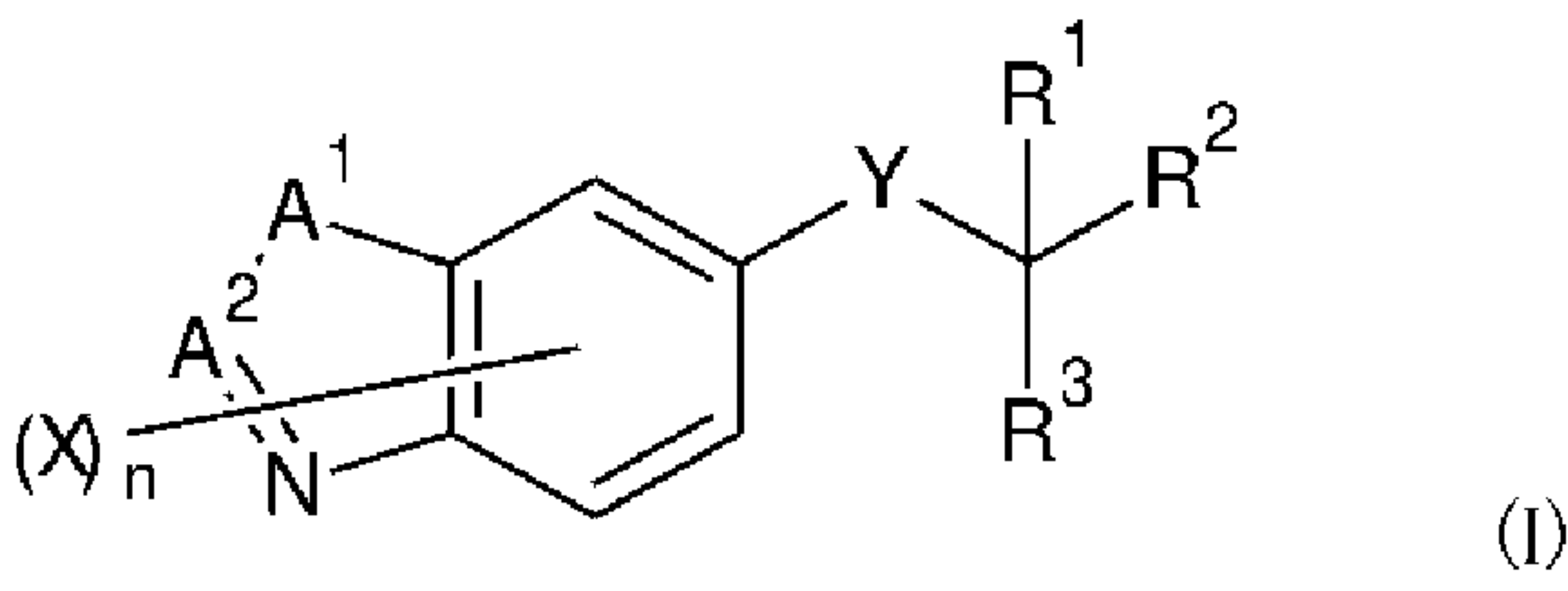
無

【實施方式】

【0021】 [雜環化合物]

本發明之雜環化合物係式（I）所表示之化合物（以下有時記為化合物（I））或化合物（I）之鹽。

【0022】



【0023】 式（I）中，

R¹為氫原子、經取代或未經取代之C1-6烷基、或鹵素基，

R²為經取代或未經取代之5～6員雜芳基，

R³為經取代或未經取代之C1-6烷基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基羰基、經取代或未經取代之C1-6烷硫基、經取代或未經取代之C6-10芳基、經取代或未經取代之5～6員雜芳基、式：「-C(Rⁱ)=NOR^j」所表示之基、或式：「-C(=O)NHR^s」所表示之基，

Rⁱ為氫原子或C1-6烷基，

R^j為經取代或未經取代之C1-6烷基，

R^s為經取代或未經取代之C1-6烷基，

Y為氧原子或NH，

A¹為硫原子、氧原子、或NR⁴，

R⁴為C1-6烷基，

A²為碳原子、或氮原子，

X為取代基，

n表示化學上容許之X之個數，且為0~3之任意整數，且

於n為2以上時，X可相互相同亦可不同。

【0024】 於本發明中，「未經取代(unsubstituted)」之用語表示僅為成為母核之基。於並無「經取代」之記載而僅以成為母核之基之名稱記載時，只要沒有特別之說明，則為「未經取代」之含義。

另一方面，「經取代(substituted)」之用語係表示成為母核之基之任一個氫原子被與母核相同或不同結構之基(取代基)取代。因此，「取代基」係與成為母核之基鍵結之其他基。取代基可為1個，亦可為2個以上。2個以上之取代基可相同，亦可不同。

「C1-6」等用語係表示成為母核之基之碳原子數為1~6個等。該碳原子數不包括取代基中之碳原子數。例如，將具有乙氧基作為取代基之丁基分類為C2烷氧基C4烷基。

【0025】 「取代基」只要於化學上容許，且具有本發明之效果，就沒有特別限制。以下例示可成為「取代基」之基。

甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、第二丁基、異丁基、第三丁基、正戊基、正己基等C1-6烷基；

乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基(烯丙基)、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基等C2-6烯基；

乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基等C2-6炔基；

【0026】 環丙基、環丁基、環戊基、環己基、立方烷基等C3-8環烷基；

苯基、萘基等C6-10芳基；

苄基、苯乙基等C6-10芳基C1-6烷基；

3～6員雜環基；

3～6員雜環基C1-6烷基；

【0027】 經基；

甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、第二丁氧基、異丁氧基、第三丁氧基等C1-6烷氧基；

乙烯氧基、烯丙氧基、丙烯氧基、丁烯氧基等C2-6烯氧基；

乙炔氧基、炔丙氧基等C2-6炔氧基；

苯氧基、萘氧基等C6-10芳氧基；

苄氧基、苯乙氧基等C6-10芳基C1-6烷氧基；

噻唑氧基、吡啶氧基等5～6員雜芳氧基；

噻唑基甲氧基、吡啶基甲氧基等5～6員雜芳基C1-6烷氧基；

3-甲氧基-1-丙炔基、3-乙氧基-1-丙炔基等C1-6烷氧基C2-6炔基；

【0028】 甲醯基；

乙醯基、丙醯基等C1-6烷基羰基；

甲醯氧基；

乙醯氧基、丙醯氧基等C1-6烷基羰氧基；

苯甲醯基等C6-10芳基羰基；

甲氧基羰基、乙氧基羰基、正丙氧基羰基、異丙氧基羰基、正丁氧基羰基、第三丁氧基羰基等C1-6烷氧基羰基；

甲氧基羰氧基、乙氧基羰氧基、正丙氧基羰氧基、異丙氧基羰氧基、正丁氧基羰氧基、第三丁氧基羰氧基等C1-6烷氧基羰氧基；

羧基；

【0029】 氟基、氯基、溴基、碘基等鹵素基；

氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基、3,3,3-三氟丙基、

2,2,3,3,3-五氟丙基、全氟丙基、2,2,2-三氟-1-三氟甲基乙基、全氟異丙基、4-氟丁基、2,2,3,3,4,4,4-七氟丁基、全氟丁基、全氟戊基、全氟己基、氯甲基、溴甲基、二氯甲基、二溴甲基、三氯甲基、三溴甲基、1-氯乙基、2,2,2-三氯乙基、4-氯丁基、全氯己基、2,4,6-三氯己基等C1-6鹵烷基；

2-氯-1-丙烯基、2-氟-1-丁烯基等C2-6鹵烯基；

4,4-二氯-1-丁炔基、4-氟-1-戊炔基、5-溴-2-戊炔基等C2-6鹵炔基；

二氟甲氧基、三氟甲氧基、2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基等C1-6鹵烷氧基；

2-氯丙烯氧基、3-溴丁烯氧基等C2-6鹵烯氧基；

氯乙醯基、三氟乙醯基、三氯乙醯基等C1-6鹵烷基羰基；

【0030】 胺基；

甲基胺基、二甲基胺基、二乙基胺基、第三丁基胺基等經C1-6烷基取代之胺基；

苯胺基、萘胺基等C6-10芳基胺基；

苄基胺基、苄乙基胺基等C6-10芳基C1-6烷基胺基；

甲醯胺基；

乙醯胺基、二乙醯胺基、丙醯基胺基、丁醯基胺基、異丙基羰基胺基等C1-6烷基羰基胺基；

甲氧基羰基胺基、乙氧基羰基胺基、正丙氧基羰基胺基、異丙氧基羰基胺基、第三丁氧基羰基胺基等C1-6烷氧基羰基胺基；

胺基羰基、二甲基胺基羰基、苯基胺基羰基、N-苯基-N-甲基胺基羰基等未經取代或具有取代基之胺基羰基；

亞胺基甲基、(1-亞胺基)乙基、(1-亞胺基)-正丙基等亞胺基C1-6烷基；

羥基亞胺基甲基；1-(羥基亞胺基)乙基、2-(羥基亞胺基)乙基等羥基亞胺基C1-6烷基；

甲氧基亞胺基甲基、1-(甲氧基亞胺基)乙基、2-(甲氧基亞胺基)乙基、乙氧基亞胺基甲基、1-(乙氧基亞胺基)乙基、2-(乙氧基亞胺基)乙基、正丙氧基亞胺基甲基、1-(正丙氧基亞胺基)乙基、2-(正丙氧基亞胺基)乙基、異丙氧基亞胺基甲基、1-(異丙氧基亞胺基)乙基、2-(異丙氧基亞胺基)乙基等C1-6烷氧基亞胺基C1-6烷基；

三氟甲氧基亞胺基甲基、1-(三氟甲氧基亞胺基)乙基、2-(三氟甲氧基亞胺基)乙基等C1-6鹵烷氧基亞胺基C1-6烷基；

胺基羰氧基；

乙基胺基羰氧基、二甲基胺基羰氧基等經C1-6烷基取代之胺基羰氧基；

【0031】 巯基；

甲巯基、乙巯基、正丙巯基、異丙巯基、正丁巯基、異丁巯基、第二丁巯基、第三丁巯基等C1-6烷巯基；

三氟甲巯基、2,2,2-三氟乙巯基等C1-6鹵烷巯基；

苯巯基、萘巯基等C6-10芳巯基；

苄巯基等C6-10芳基C1-6烷巯基；

噻唑巯基、吡啶巯基等5～6員雜芳巯基；

【0032】 甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、第三丁基亞磺醯基等C1-6烷基亞磺醯基；

三氟甲基亞磺醯基、2,2,2-三氟乙基亞磺醯基等C1-6鹵烷基亞磺醯基；

苯基亞磺醯基等C6-10芳基亞磺醯基；

噻唑基亞磺醯基、吡啶基亞磺醯基等5～6員雜芳基亞磺醯基；

【0033】 甲基磺醯基、乙基磺醯基、第三丁基磺醯基等C1-6烷基磺醯基；

三氟甲基磺醯基、2,2,2-三氟乙基磺醯基等C1-6鹵烷基磺醯基；

苯基磺醯基等C6-10芳基磺醯基；

噻唑基磺醯基、吡啶基磺醯基等5~6員雜芳基磺醯基；

甲基磺醯氧基、乙基磺醯氧基、第三丁基磺醯氧基等C1-6烷基磺醯氧基；

三氟甲基磺醯氧基、2,2,2-三氟乙基磺醯氧基等C1-6鹵烷基磺醯氧基；

【0034】 三甲基矽基、三乙基矽基、第三丁基二甲基矽基等經三C1-6烷基取代之矽基；

三苯基矽基等經三C6-10芳基取代之矽基；

氰基；硝基；

【0035】 羥甲基、2-羥乙基等羥基C1-6烷基；

第三丁基二甲基矽基氧基甲基、2-第三丁基二甲基矽基氧基乙基等經三C1-6烷基取代之矽基氧基C1-6烷基；

甲氧基甲基、乙氧基甲基、二甲氧基甲基等C1-6烷氧基C1-6烷基；

乙醯氧基甲基等C1-6烷基羰氧基C1-6烷基；

(甲氧基甲氧基)甲基、(2-甲氧基乙氧基)甲基、(1-乙氧基乙氧基)甲基、(1-異丙氧基乙氧基)甲基、((2-甲氧基丙烷-2-基)氧基)甲基等C1-6烷氧基C1-6烷氧基C1-6烷基；

((2-甲氧基乙氧基)甲氧基)甲基等C1-6烷氧基C1-6烷氧基C1-6烷氧基C1-6烷基；

((甲氧基羰基)氧基)甲基等C1-6烷氧基羰氧基C1-6烷基；

(2-甲氧基乙醯氧基)甲基、((3-甲氧基丙醯基)氧基)甲基等C1-6烷氧基C1-6烷基羰基C1-6烷基；

((甲硫基)甲氧基)甲基等C1-6烷硫基C1-6烷氧基C1-6烷基；

((甲基胺甲醯基)氧基)甲基、((二甲基胺甲醯基)氧基)甲基等經C1-6烷基取代之胺基羰氧基C1-6烷基；

氰基甲基、2-氰基乙基、3-氰基丙基等經氰基取代之C1-6烷基；

(1,3-二氧戊環-2-基)甲基 ((1,3-dioxolan-2-yl)methyl)、2-(1,3-二氧戊環-2-基)乙基、(1,3-二噁烷-2-基)甲基、2-(1,3-二噁烷-2-基)乙基等經5～6員飽和雜環基取代之C1-6烷基；

3-甲氧基-1-丙炔基等C1-6烷氧基C2-6炔基；

甲氧基甲氧基、2-甲氧基乙氧基等C1-6烷氧基C1-6烷氧基。

【0036】 又，至於該等「取代基」，該取代基中之任意氫原子亦可經結構不同之基取代。作為此情形時之「取代基」，可列舉C1-6烷基、C1-6鹵烷基、C1-6烷氧基、C1-6鹵烷氧基、羥基、C1-6烷氧基、C1-6烷硫基、C1-6烷基亞磺醯基、C1-6烷基磺醯基、經三C1-6烷基取代之矽基、鹵素基、氰基、硝基等。

【0037】 又，上述「3～6員雜環基」係指包含選自由氮原子、氧原子及硫原子所組成之群之1～4個雜原子作為環之構成原子者。雜環基可為單環及多環之任意者。至於多環雜環基，若至少一個環為雜環，則其餘之環可為飽和脂環、不飽和脂環或芳香環之任意者。作為「3～6員雜環基」，可列舉3～6員飽和雜環基、5～6員雜芳基、5～6員部分不飽和雜環基等。

【0038】 作為3～6員飽和雜環基，可列舉氮丙啶基、環氧基、吡咯啶基、四氫呋喃基、四氫噻唑基、哌啶基、哌啶基、咪啉基、二氧戊環基 (dioxolanyl)、二噁烷基、二硫戊環基 (dithiolanyl) 等。

【0039】 作為5員雜芳基，可列舉吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、異噁唑基、噻唑基、異噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等。

作為6員雜芳基，可列舉吡啶基、吡啶基、嘧啶基、嗒啶基、三吡啶基等。

作為5～6員部分不飽和雜環基，可列舉二氫吡喃基 (dihydropyranyl)、4,5-二氫異噁唑基等。

【0040】 [R¹]

式(I)中， R^1 表示氫原子、經取代或未經取代之C1-6烷基、或鹵素基。

【0041】 R^1 中之「C1-6烷基」可為直鏈，亦可為支鏈。作為烷基，可列舉甲基、乙基、正丙基、正丁基、正戊基、正己基、異丙基、異丁基、第二丁基、第三丁基、異戊基、新戊基、2-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、異己基等。

【0042】 作為「具有取代基之C1-6烷基」之具體例，可列舉：

氟甲基、氯甲基、溴甲基、二氟甲基、二氯甲基、二溴甲基、三氟甲基、三氯甲基、三溴甲基、1-氯乙基、2,2,2-三氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基、4-氟丁基、2,2,3,3,4,4,4-七氟丁基、4-氯丁基、3,3,3-三氟丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、1,1,1,3,3,3-六氟丙烷-2-基、全氟丙烷-2-基、全氟己基、全氯己基、2,4,6-三氯己基等C1-6鹵烷基；

【0043】 羥甲基、羥乙基等羥基C1-6烷基；

甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、甲氧基-正丙基、正丙氧基甲基、異丙氧基乙基、第二丁氧基甲基、第三丁氧基乙基等C1-6烷氧基C1-6烷基；

苄基、苯乙基等C6-10芳基C1-6烷基；

環丙基甲基、2-環丙基乙基、環戊基甲基、2-環己基乙基、2-環辛基乙基等C3-8環烷基C1-6烷基等。

【0044】 作為 R^1 中之「C1-6烷基」上之取代基，可較佳地列舉：氟基、氯基、溴基、碘基等鹵素基；甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、第二丁氧基、異丁氧基、第三丁氧基等C1-6烷氧基；2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基、三氟甲氧基等C1-6鹵烷氧基；氰基。

【0045】 作為 R^1 中之「鹵素基」，可列舉氟基、氯基、溴基、碘基等。

【0046】 R^1 較佳為氫原子。

【0047】 $[R^2]$

式(I)中， R^2 表示經取代或未經取代之5~6員雜芳基。

【0048】 作為 R^2 中之「5~6員雜芳基」，可列舉：吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、異噁唑基、噻唑基、異噻唑基、三唑基、噁二唑基、四唑基等5員環之雜芳基；吡啶基、吡嗪基、嘧啶基、嗒嗪基、三嗪基等6員環之雜芳基。

【0049】 作為 R^2 中之「5~6員雜芳基」上之取代基，可較佳地列舉：甲基、乙基、正丙基、正丁基、正戊基、正己基、異丙基、異丁基、第二丁基、第三丁基、異戊基、新戊基、2-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、異己基等C1-6烷基；氟基、氯基、溴基、碘基等鹵素基。

【0050】 R^2 較佳為5員雜芳基，更佳為噁二唑基，尤佳為1,3,4-噁二唑-2-基。

【0051】 [R^3]

式(I)中， R^3 為經取代或未經取代之C1-6烷基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基羰基、經取代或未經取代之C1-6烷硫基、經取代或未經取代之C6-10芳基、經取代或未經取代之5~6員雜芳基、式：「 $-C(R^i)=NOR^j$ 」所表示之基或式：「 $-C(=O)NHR^s$ 」所表示之基。

【0052】 作為 R^3 中之「C1-6烷基」，可列舉與 R^1 中所具體地例示之該等相同者。

【0053】 作為 R^3 中之「5~6員雜芳基」，可列舉與 R^2 中所具體地例示之該等相同者。該等中，較佳為吡啶基、嘧啶基、噻唑基、吡嗪基。

【0054】 作為 R^3 中之「C1-6烷氧基羰基」，可列舉甲氧基羰基、乙氧基羰基、正丙氧基羰基、異丙氧基羰基、正丁氧基羰基、第三丁氧基羰基等。

【0055】 作為 R^3 中之「C1-6烷硫基」，可列舉甲硫基、乙硫基、正丙硫基、正丁硫基、正戊硫基、正己硫基、異丙硫基等。

【0056】 作為 R^3 中之「C1-6烷基」、「C1-6烷氧基羰基」、「C1-6烷硫基」上

之取代基，可較佳地列舉氟基、氯基、溴基、碘基等鹵素基。

【0057】 R^3 中之「C6-10芳基」係單環或多環之芳香族烴環上之氫被脫去一個而形成之基。作為「C6-10芳基」，可列舉苯基、萘基等，較佳為苯基。

【0058】 作為 R^3 中之「C6-10芳基」、及「5~6員雜芳基」上之取代基（以下，有時記載為 G^1 ），可列舉經取代或未經取代之C1-6烷基、經取代或未經取代之C2-6烯基、經取代或未經取代之C2-6炔基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基羰基、經取代或未經取代之C1-6烷硫基、經取代或未經取代之C1-6烷基亞磺醯基、經取代或未經取代之C1-6烷基磺醯基、經取代或未經取代之C6-10芳基、經取代或未經取代之5~6員雜環基、鹵素基、氰基、硝基、式：「 $-C(R^g)=NOR^h$ 」所表示之基、式：「 $-O-N=CR^cR^d$ 」所表示之基、或式：「 $-C(=O)NR^pR^q$ 」所表示之基。

【0059】 作為 G^1 中之「C1-6烷基」、「鹵素基」，可列舉與 R^1 中所具體地例示之該等相同者。

【0060】 作為 G^1 中之「經取代之C1-6烷基」，可列舉：經甲基、2-經乙基等經基C1-6烷基；第三丁基二甲基矽基氧基甲基、2-第三丁基二甲基矽基氧基乙基等經三C1-6烷基取代之矽基氧基C1-6烷基；甲氧基甲基、乙氧基甲基、二甲氧基甲基等C1-6烷氧基C1-6烷基；甲硫基甲基等C1-6烷硫基C1-6烷基；乙醯氧基甲基等C1-6烷基羰氧基C1-6烷基；(甲氧基甲氧基)甲基、(2-甲氧基乙氧基)甲基、(1-乙氧基乙氧基)甲基、(1-異丙氧基乙氧基)甲基、((2-甲氧基丙烷-2-基)氧基)甲基等C1-6烷氧基C1-6烷氧基C1-6烷基；((2-甲氧基乙氧基)甲氧基)甲基等C1-6烷氧基C1-6烷氧基C1-6烷氧基C1-6烷基；((甲氧基羰基)氧基)甲基等C1-6烷氧基羰氧基C1-6烷基；(2-甲氧基乙醯氧基)甲基、((3-甲氧基丙醯基)氧基)甲基等C1-6烷氧基C1-6烷基羰氧基C1-6烷基；((甲硫基)甲氧基)甲基等C1-6烷硫基C1-6烷氧基C1-6烷基；((甲基胺甲醯基)氧基)甲基、((二甲基胺甲醯基)氧基)甲基等經C1-6烷基

取代之胺基羰氧基C1-6烷基；氰基甲基、2-氰基乙基、3-氰基丙基等經氰基取代之C1-6烷基；苄基、苯乙基等C6-10芳基C1-6烷基；(1,3-二氧戊環-2-基)甲基、2-(1,3-二氧戊環-2-基)乙基、(1,3-二噁烷-2-基)甲基、2-(1,3-二噁烷-2-基)乙基等經5～6員飽和雜環基取代之C1-6烷基等。

【0061】 作為G¹中之「C1-6烷基」上之取代基，可較佳地列舉：羥基；第三丁基二甲基矽基氧基、2-第三丁基二甲基矽基氧基等經三C1-6烷基取代之矽基氧基；甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、第二丁氧基、異丁氧基、第三丁氧基等C1-6烷氧基；甲硫基、乙硫基、正丙硫基、異丙硫基、正丁硫基、異丁硫基、第二丁硫基、第三丁硫基等C1-6烷硫基；乙醯氧基、丙醯氧基等C1-6烷基羰氧基；甲氧基甲氧基、1-甲氧基乙氧基、2-甲氧基乙氧基、1-乙氧基乙氧基、2-乙氧基乙氧基、1-異丙氧基乙氧基、2-異丙氧基乙氧基、(2-甲氧基丙烷-2-基)氧基等C1-6烷氧基C1-6烷氧基；(2-甲氧基乙氧基)甲氧基等C1-6烷氧基C1-6烷氧基C1-6烷氧基；甲氧基羰氧基、乙氧基羰氧基等C1-6烷氧基羰氧基；2-甲氧基乙醯氧基、(3-甲氧基丙醯基)氧基等C1-6烷氧基C1-6烷基羰氧基；甲硫基甲氧基等C1-6烷硫基C1-6烷氧基；(甲基胺甲醯基)氧基、(二甲基胺甲醯基)氧基等經C1-6烷基取代之胺基羰氧基；氰基；苯基、萘基等C6-10芳基；吡咯啉基、四氫呋喃基、四氫噻唑基、哌啉基、哌啶基、咪啉基、二氧戊環基、二噁烷基、二硫戊環基等5～6員飽和雜環基等。

【0062】 作為G¹中之「C2-6烯基」，可列舉：乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基（烯丙基）、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基等。

【0063】 作為G¹中之「C2-6炔基」，可列舉：乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、2-甲基-3-丁炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、2-甲基-3-戊炔基、1-己炔基、

1,1-二甲基-2-丁炔基等。

【0064】 作為 G^1 中之「C1-6烷氧基」，可列舉：甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、第二丁氧基、異丁氧基、第三丁氧基等。

【0065】 作為 G^1 中之「C1-6烷氧基羰基」及「C1-6烷硫基」，可列舉與 R^3 中所具體地例示之該等相同者。

【0066】 作為 G^1 中之「C1-6烷基亞磺醯基」，可列舉：甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、第三丁基亞磺醯基等。

【0067】 作為 G^1 中之「C1-6烷基磺醯基」，可列舉：甲基磺醯基、乙基磺醯基、第三丁基磺醯基等。

【0068】 作為 G^1 中之「C2-6烯基」、「C2-6炔基」、「C1-6烷氧基」、「C1-6烷氧基羰基」、「C1-6烷硫基」、「C1-6烷基亞磺醯基」及「C1-6烷基磺醯基」上之取代基，可較佳地列舉：甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、第二丁氧基、異丁氧基、第三丁氧基等C1-6烷氧基。

【0069】 作為 G^1 中之「C6-10芳基」，可列舉與 R^3 中所具體地例示之該等相同者。

【0070】 作為 G^1 中之「5~6員雜環基」，可列舉吡咯啉基、四氫呋喃基、四氫噻唑基、哌啉基、哌啶基、咪唑基、咪唑基、二氧戊環基、二噁烷基、二硫戊環基等5~6員飽和雜環基；作為5~6員部分不飽和雜環基之二氫吡喃基、4,5-二氫異噁唑基；吡咯基、呋喃基、噻吩基、咪唑基、吡唑基、噁唑基、異噁唑基、噻唑基、異噻唑基、三唑基、噁二唑基、噻二唑基、四唑基等5員環之雜芳基；吡啉基、吡啶基、嘧啶基、嘧啶基、三嘧啶基等6員環之雜芳基。該等中，較佳為二氧戊環基、二噁烷基、二硫戊環基、呋喃基、噻吩基、吡唑基、異噁唑基、吡啉基、嘧啶基、二氫吡喃基。

【0071】 作為 G^1 中之「C6-10芳基」及「5~6員雜環基」上之取代基，可

較佳地列舉：氟基、氯基、溴基、碘基等鹵素基；甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、第二丁基、異丁基、第三丁基、正戊基、正己基等C1-6烷基；經基；甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、第二丁氧基、異丁氧基、第三丁氧基等C1-6烷氧基。

【0072】 G^1 中之式：「 $-C(R^g)=NOR^h$ 」中， R^g 為氫原子、C1-6烷基或胺基，較佳為氫原子。

作為 R^g 中之「C1-6烷基」，可列舉與 R^1 中所具體地例示之該等相同者。

【0073】 G^1 中之式：「 $-C(R^g)=NOR^h$ 」中， R^h 為氫原子、經取代或未經取代之C1-6烷基、或C2-6炔基。

【0074】 作為 R^h 中之「C1-6烷基」，可列舉與 R^1 中所具體地例示之該等相同者。

【0075】 作為 R^h 中之「經取代之C1-6烷基」，可列舉：氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基、3,3,3-三氟丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、全氟丙基、2,2,2-三氟-1-三氟甲基乙基、全氟異丙基、4-氟丁基、2,2,3,3,4,4,4-七氟丁基、全氟丁基、全氟戊基、全氟己基、氯甲基、溴甲基、二氯甲基、二溴甲基、三氯甲基、三溴甲基、1-氯乙基、2,2,2-三氯乙基、4-氯丁基、全氯己基、2,4,6-三氯己基等C1-6鹵烷基；甲氧基甲基、乙氧基甲基、2-甲氧基乙基、2-乙氧基乙基等C1-6烷氧基C1-6烷基；環丙基甲基等C3-8環烷基C1-6烷基；苺基、苺乙基等C6-10芳基C1-6烷基；(1,3,4-噁二唑-2-基)甲基、(吡啶-2-基)甲基等5～6員雜芳基C1-6烷基。該等中，較佳為C1-6烷氧基C1-6烷基、C3-8環烷基C1-6烷基、5～6員雜芳基C1-6烷基。

【0076】 作為 R^h 中之「C2-6炔基」，可列舉與 G^1 中所具體地例示之該等相同者。

【0077】 G^1 中之式：「 $-O-N=CR^cR^d$ 」中， R^c 及 R^d 各自獨立地為氫原子、或

C1-6烷基。

作為 R^c 及 R^d 中之「C1-6烷基」，可列舉與 R^1 中所具體地例示之該等相同者。

【0078】 G^1 中之式：「 $-C(=O)NR^pR^q$ 」中， R^p 及 R^q 各自獨立地為氫原子或C1-6烷基。

作為 R^p 及 R^q 中之「C1-6烷基」，可列舉與 R^1 中所具體地例示之該等相同者。

【0079】 G^1 較佳為經取代或未經取代之C1-6烷基、經取代或未經取代之C2-6烯基、經取代或未經取代之C2-6炔基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基羰基、經取代或未經取代之C1-6烷硫基、經取代或未經取代之C1-6烷基亞磺醯基、經取代或未經取代之C1-6烷基磺醯基、經取代或未經取代之C6-10芳基、經取代或未經取代之5~6員雜環基、鹵素基、氰基、式：「 $-C(R^g)=NOR^h$ 」所表示之基、或式：「 $-O-N=CR^cR^d$ 」所表示之基，更佳為經取代或未經取代之C1-6烷基、經取代或未經取代之C2-6烯基、經取代或未經取代之C2-6炔基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基、經取代或未經取代之C1-6烷硫基、經取代或未經取代之C1-6烷基亞磺醯基、經取代或未經取代之C6-10芳基、經取代或未經取代之5~6員雜環基、鹵素基、氰基、式：「 $-C(R^g)=NOR^h$ 」所表示之基、或式：「 $-O-N=CR^cR^d$ 」所表示之基。

【0080】 式：「 $-C(R^i)=NOR^j$ 」中， R^i 為氫原子、C1-6烷基，較佳為氫原子。

式：「 $-C(R^i)=NOR^j$ 」中， R^j 為經取代或未經取代之C1-6烷基。

R^i 及 R^j 中之「C1-6烷基」可列舉與 R^1 中所具體地例示之該等相同者。

R^j 中之「經取代之C1-6烷基」可列舉：苺基、苺乙基等C6-10芳基C1-6烷基；甲氧基甲基、乙氧基甲基、2-甲氧基乙基、2-乙氧基乙基等C1-6烷氧基C1-6烷基，較佳為苺基。

【0081】 式：「 $-C(=O)NHR^s$ 」中， R^s 為經取代或未經取代之C1-6烷基。

R^s 中之「C1-6烷基」可列舉與 R^1 中所具體地例示之該等相同者。

作為 R^s 中之「經取代之C1-6烷基」，可列舉甲氧基亞胺基甲基、乙氧基亞胺基甲基、2-甲氧基亞胺基乙基、2-乙氧基亞胺基乙基、1-(甲氧基亞胺基)丙烷-2-基、1-(乙氧基亞胺基)丙烷-2-基、1-(甲氧基亞胺基)-2-甲基丙烷-2-基、1-(乙氧基亞胺基)-2-甲基丙烷-2-基等經C1-6烷氧基亞胺基取代之C1-6烷基。

【0082】 R^3 較佳為C1-6烷基、經取代或未經取代之C6-10芳基、或經取代或未經取代之5~6員雜芳基，更佳為經取代或未經取代之C6-10芳基、或經取代或未經取代之5~6員雜芳基，進而較佳為經取代或未經取代之苯基、或經取代或未經取代之5~6員雜芳基，尤佳為經取代或未經取代之6員雜芳基。

【0083】 [Y]

式(I)中，Y為氧原子或NH。

Y較佳為氧原子。

【0084】 [X]

式(I)中，X表示取代基。作為取代基X，可列舉已經敘述者等。

【0085】 作為取代基X(以下，有時記作 G^2)，可較佳地列舉經取代或未經取代之C1-6烷基、經取代或未經取代之C2-6烯基、經取代或未經取代之C2-6炔基、羥基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基羰基、經取代或未經取代之C1-6烷硫基、經取代或未經取代之C3-8環烷基、經取代或未經取代之C6-10芳基、鹵素基、氰基、式：「 $-NR^aR^b$ 」所表示之基(式中， R^a 及 R^b 各自獨立地為氫原子、C1-6烷基、或C1-6烷氧基羰基)、或式：「 $-C(R^e)=NOR^f$ 」所表示之基(式中， R^e 及 R^f 各自獨立地為氫原子、或C1-6烷基)。

【0086】 作為 G^2 中之「C1-6烷基」、「鹵素基」，可列舉與 R^1 中所具體地例示之該等相同者。

【0087】 作為 G^2 中之「經取代之C1-6烷基」，可列舉：氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基、3,3,3-三氟丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、全

氟丙基、2,2,2-三氟-1-三氟甲基乙基、全氟異丙基、4-氟丁基、2,2,3,3,4,4,4-七氟丁基、全氟丁基、全氟戊基、全氟己基、氯甲基、溴甲基、二氯甲基、二溴甲基、三氯甲基、三溴甲基、1-氯乙基、2,2,2-三氯乙基、4-氯丁基、全氯己基、2,4,6-三氯己基等C1-6鹵烷基；羥甲基、2-羥乙基等羥基C1-6烷基；甲氧基甲基、乙氧基甲基、2-甲氧基乙基、2-乙氧基乙基等C1-6烷氧基C1-6烷基。

【0088】 作為G²中之「C1-6烷基」上之取代基，可較佳地列舉：氟基、氯基、溴基、碘基等鹵素基；羥基；甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、第二丁氧基、異丁氧基、第三丁氧基等C1-6烷氧基。

【0089】 作為G²中之「C3-8環烷基」，可列舉環丙基、環丁基、環戊基、環己基、立方烷基，較佳為環丙基。

【0090】 作為G²中之「C1-6烷氧基羰基」及「C1-6烷硫基」，可列舉與R³中所具體地例示之該等相同者。

【0091】 作為G²中之「C2-6烯基」，可列舉：乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基（烯丙基）、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基等。

【0092】 作為G²中之「C2-6炔基」、「C1-6烷氧基」，可列舉與G¹中所具體地例示之該等相同者。

【0093】 作為G²中之「C2-6烯基」、「C2-6炔基」、「C1-6烷氧基」、「C1-6烷氧基羰基」、「C1-6烷硫基」、「C3-8環烷基」上之取代基，可較佳地列舉氟基、氯基、溴基、碘基等鹵素基。

【0094】 作為G²中之「C6-10芳基」，可列舉與R³中所具體地例示之該等相同者，較佳為苯基。

【0095】 作為G²中之「C6-10芳基」上之取代基，可較佳地列舉：氟基、氯基、溴基、碘基等鹵素基；甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、第二丁基、

異丁基、第三丁基、正戊基、正己基等C1-6烷基；氟甲基、二氟甲基、三氟甲基、2,2,2-三氟乙基、五氟乙基、3,3,3-三氟丙基、2,2,3,3,3-五氟丙基、全氟丙基、2,2,2-三氟-1-三氟甲基乙基、全氟異丙基、4-氟丁基、2,2,3,3,4,4,4-七氟丁基、全氟丁基、全氟戊基、全氟己基、氯甲基、溴甲基、二氯甲基、二溴甲基、三氯甲基、三溴甲基、1-氯乙基、2,2,2-三氯乙基、4-氯丁基、全氯己基、2,4,6-三氯己基等C1-6鹵烷基；甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、第二丁氧基、異丁氧基、第三丁氧基等C1-6烷氧基；二氟甲氧基、三氟甲氧基、2-氯正丙氧基、2,3-二氯丁氧基等C1-6鹵烷氧基；甲硫基、乙硫基、正丙硫基、正丁硫基、正戊硫基、正己硫基、異丙硫基等C1-6烷硫基；甲基亞磺醯基、乙基亞磺醯基、第三丁基亞磺醯基等C1-6烷基亞磺醯基；甲基磺醯基、乙基磺醯基、第三丁基磺醯基等C1-6烷基磺醯基；氰基，更佳地列舉C1-6鹵烷基、C1-6烷氧基、C1-6鹵烷氧基。

【0096】 式：「 $-NR^aR^b$ 」中， R^a 及 R^b 各自獨立地為氫原子、C1-6烷基、或C1-6烷氧基羰基。

【0097】 作為 R^a 及 R^b 中之「C1-6烷基」，可列舉與 R^1 中所具體地例示之該等相同者。

【0098】 作為 R^a 及 R^b 中之「C1-6烷氧基羰基」，可列舉與 R^3 中所具體地例示之該等相同者。

【0099】 R^a 較佳為氫原子， R^b 較佳為氫原子或C1-6烷基。

【0100】 式：「 $-C(R^e)=NOR^f$ 」中， R^e 及 R^f 各自獨立地為氫原子、或C1-6烷基。

作為 R^e 及 R^f 中之「C1-6烷基」，可列舉與 R^1 中所具體地例示之該等相同者。

【0101】 G^2 更佳為經取代或未經取代之C1-6烷基、C3-8環烷基、經取代或未經取代之C2-6烯基、經取代或未經取代之C2-6炔基、羥基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基羰基、經取代或未經取代之C1-

6烷硫基、經取代或未經取代之C6-10芳基、鹵素基、氰基、或式：「-NR^aR^b」所表示之基，更佳為經取代或未經取代之C1-6烷基、C3-8環烷基、C2-6烯基、C2-6炔基、C1-6烷氧基、C1-6烷氧基羰基、經取代或未經取代之C1-6烷硫基、經取代或未經取代之C6-10芳基、鹵素基、氰基、或式：「-NR^aR^b」所表示之基。

【0102】 [n]

式(I)中，n表示化學上容許之X之個數，且為0~3之任意整數，較佳為0~2之任意整數，更較佳為0或1。於n為2以上時，X可相互相同亦可不同。

【0103】 [A¹、A²]

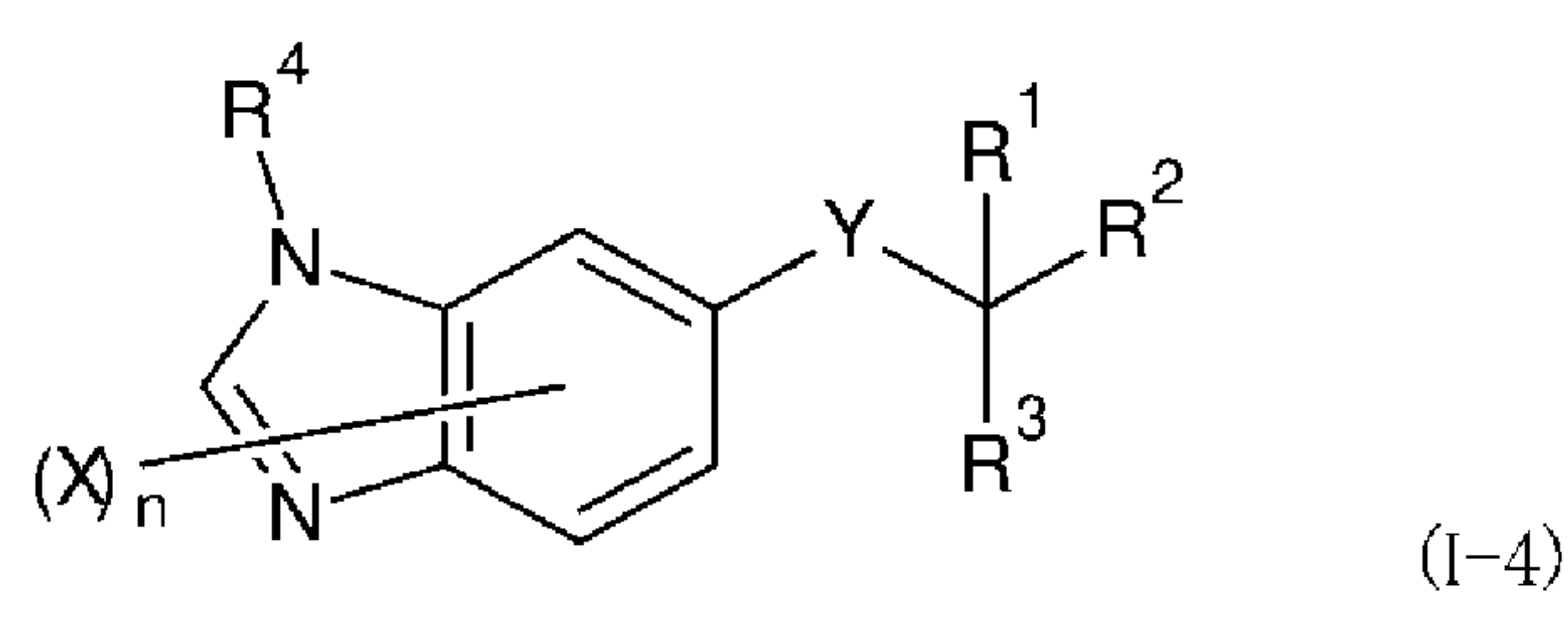
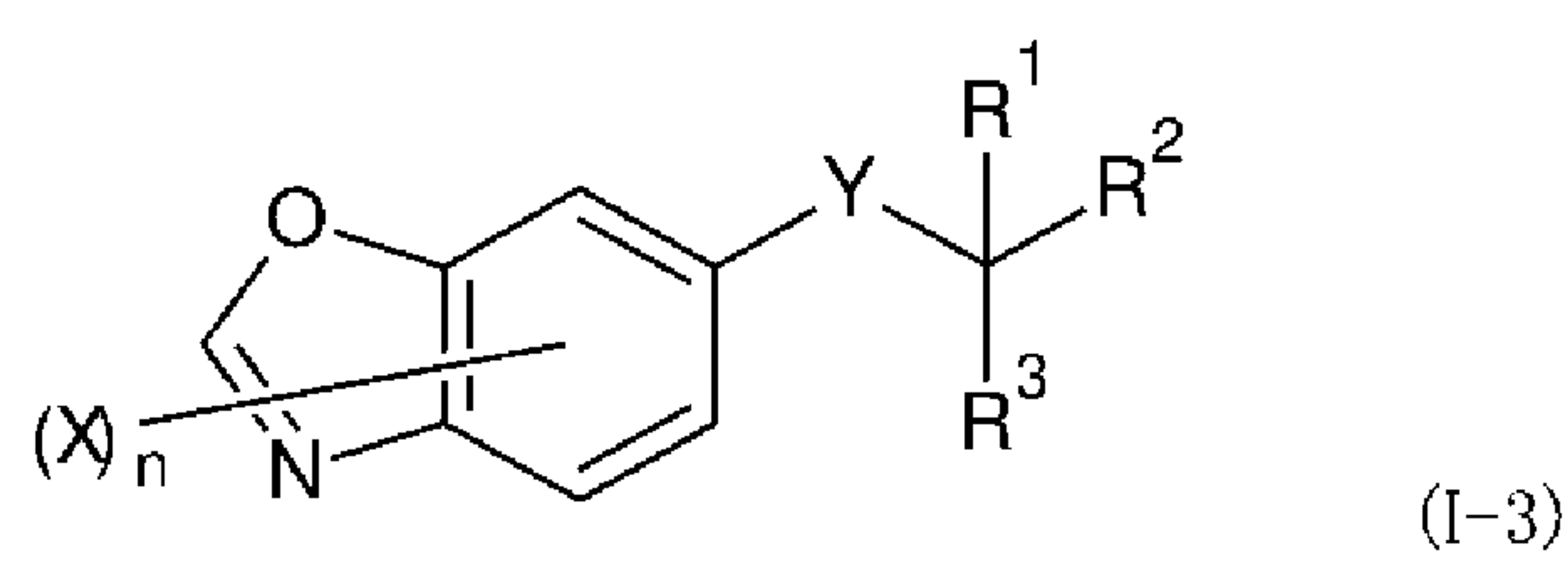
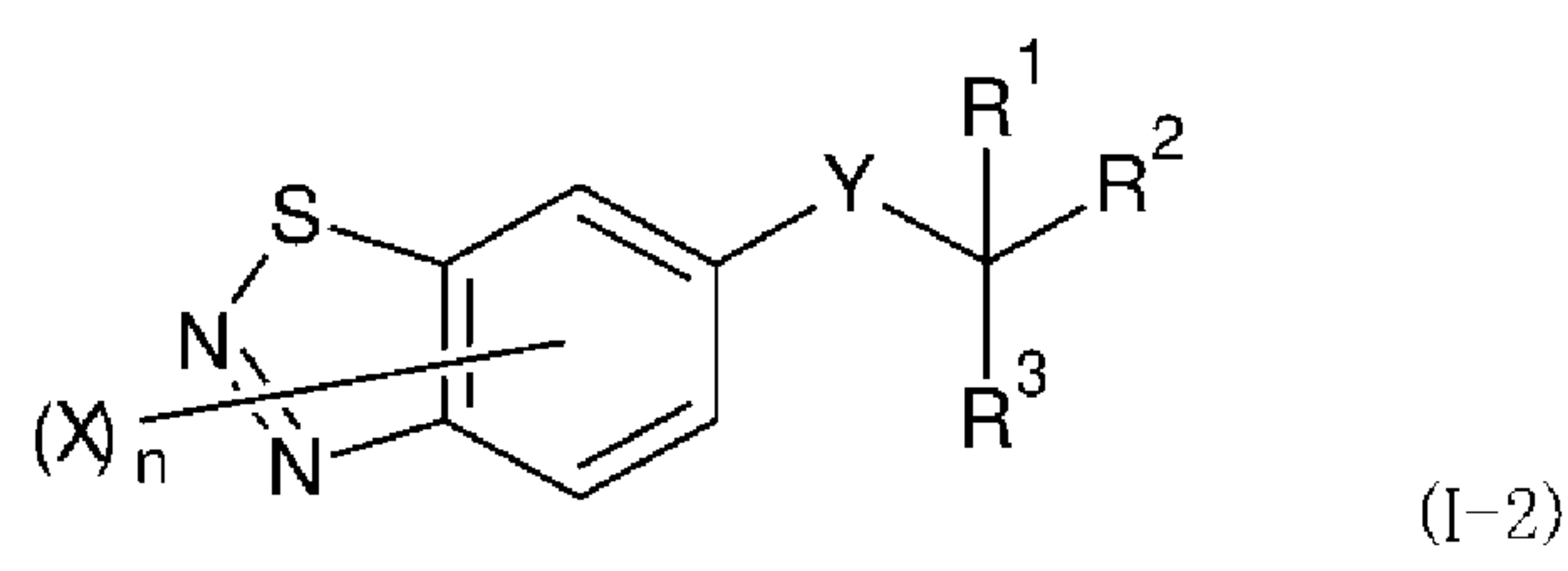
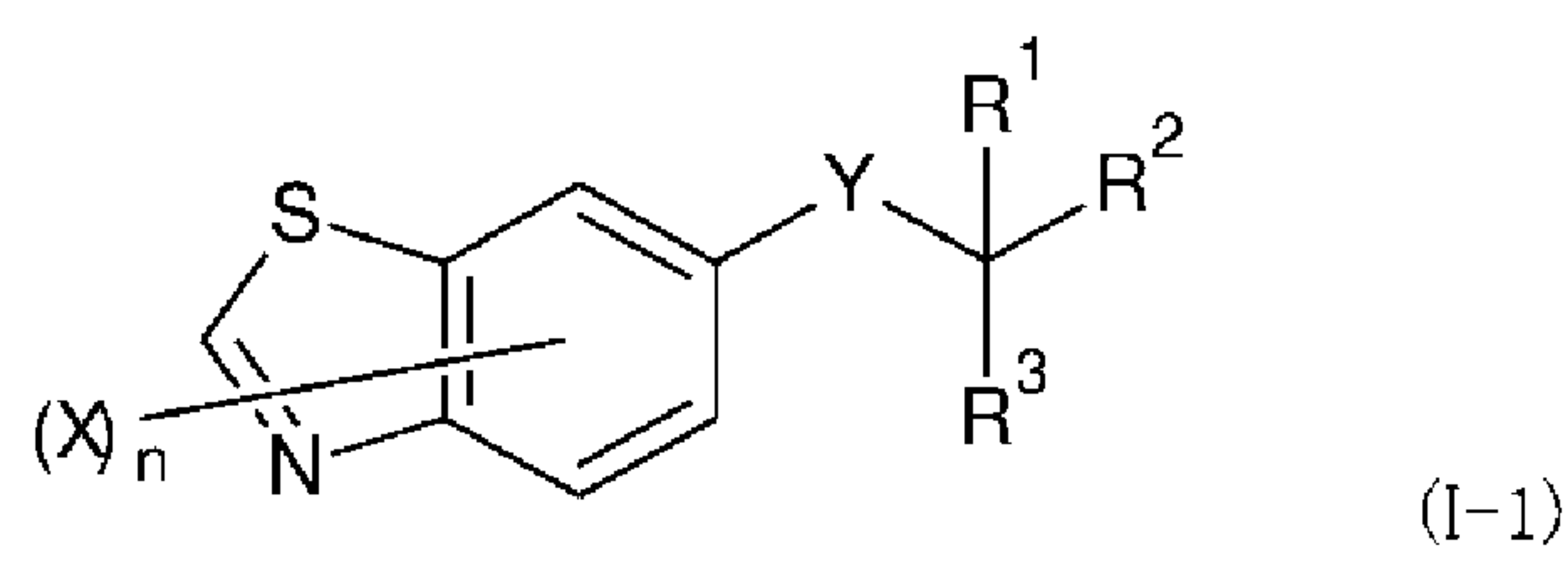
式(I)中，A¹為硫原子、氧原子、或NR⁴，R⁴為C1-6烷基。

式(I)中，A²為碳原子、或氮原子。

【0104】 作為R⁴中之「C1-6烷基」，可列舉與R¹中所具體地例示之該等相同者。

【0105】 式(I)所表示之化合物較佳為式(I-1)~式(I-4)所表示之化合物之任意者。

【0106】



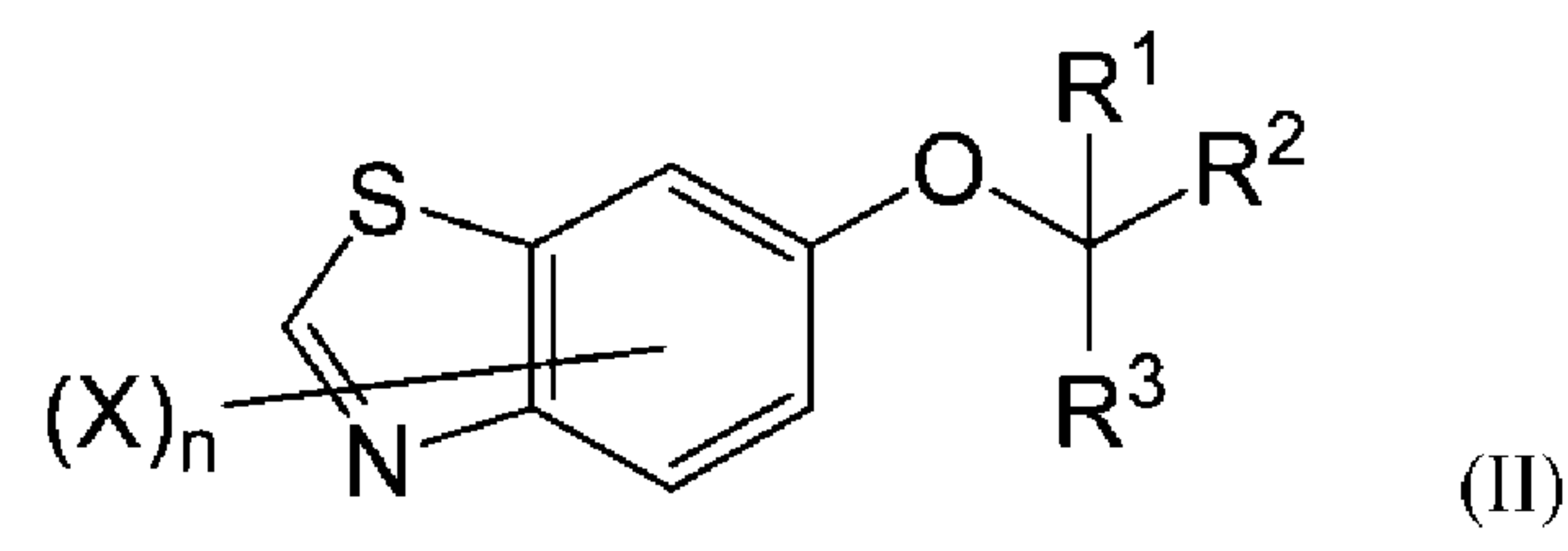
【0107】 式 (I-1) ~ 式 (I-4) 中， R^1 、 R^2 、 R^3 、Y、X及n為與式 (I) 中之該等相同之含義，式 (I-4) 中， R^4 為與上述者相同之含義。

式 (I) 所表示之化合物較佳為式 (I-1) 所表示之化合物。

【0108】 [式 (II) 所表示之化合物]

式 (I) 所表示之化合物較佳為式 (II) 所表示之化合物。

【0109】



【0110】 式 (II) 中， R^1 、 R^2 、 R^3 、X及n表示與式 (I) 中之該等相同之含

或胺基， R^h 為氫原子、經取代或未經取代之C1-6烷基、或C2-6炔基)所表示之基、式：「 $-O-N=CR^cR^d$ 」(式中， R^c 及 R^d 各自獨立地為氫原子、或C1-6烷基)所表示之基、或式：「 $-C(=O)NR^pR^q$ 」(R^p 及 R^q 各自獨立地為氫原子或C1-6烷基)可列舉與 G^1 中所具體地例示之該等相同者。

【0115】 R^4 、 R^5 、 R^6 及 R^7 較佳為各自獨立地為氫原子、經取代或未經取代之C1-6烷基、經取代或未經取代之C2-6烯基、經取代或未經取代之C2-6炔基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基羰基、經取代或未經取代之C1-6烷硫基、經取代或未經取代之C1-6烷基亞磺醯基、經取代或未經取代之C1-6烷基磺醯基、經取代或未經取代之C6-10芳基、經取代或未經取代之5~6員雜環基、鹵素基、氰基、式：「 $-C(R^g)=NOR^h$ 」所表示之基、或式：「 $-O-N=CR^cR^d$ 」所表示之基。

R^4 及 R^7 更佳為氫原子、經取代或未經取代之C1-6烷基、或式：「 $-C(R^g)=NOR^h$ 」所表示之基，尤佳為氫原子。

R^5 及 R^6 更佳為氫原子、經取代或未經取代之C1-6烷基、經取代或未經取代之C2-6烯基、經取代或未經取代之C2-6炔基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基、經取代或未經取代之C1-6烷硫基、經取代或未經取代之C1-6烷基亞磺醯基、經取代或未經取代之C6-10芳基、經取代或未經取代之5~6員雜環基、鹵素基、氰基、式：「 $-C(R^g)=NOR^h$ 」所表示之基、或式：「 $-O-N=CR^cR^d$ 」所表示之基。

【0116】 化合物(I)之鹽若為農園藝學上容許之鹽，則並無特別限制。例如，可列舉：鹽酸、硫酸等無機酸之鹽；乙酸、乳酸等有機酸之鹽；鋰、鈉、鉀等鹼金屬之鹽；鈣、鎂等鹼土金屬之鹽；鐵、銅等過渡金屬之鹽；氨、三乙胺、三丁胺、吡啶、胍等有機鹼之鹽等。

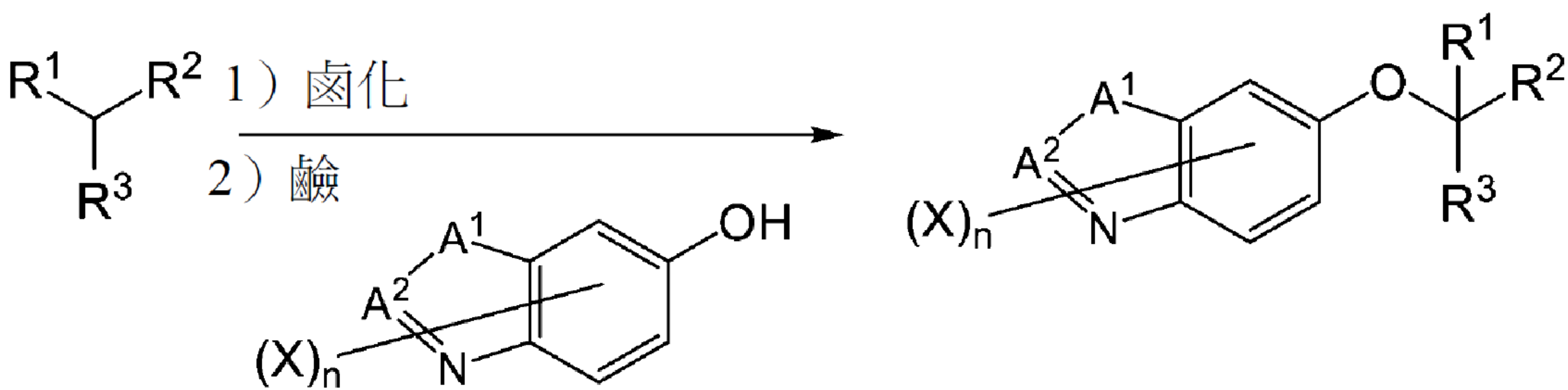
【0117】 化合物(I)或化合物(I)之鹽不受其製造方法之特別限定。又，化合物(I)之鹽可藉由公知之方法而由化合物(I)獲得。例如，本發明之化合

物 (I) 或化合物 (I) 之鹽可藉由實施例等中所記載之公知之製造方法獲得。

本發明化合物例如可藉由以下所示之方法而製造。

(合成方法1)

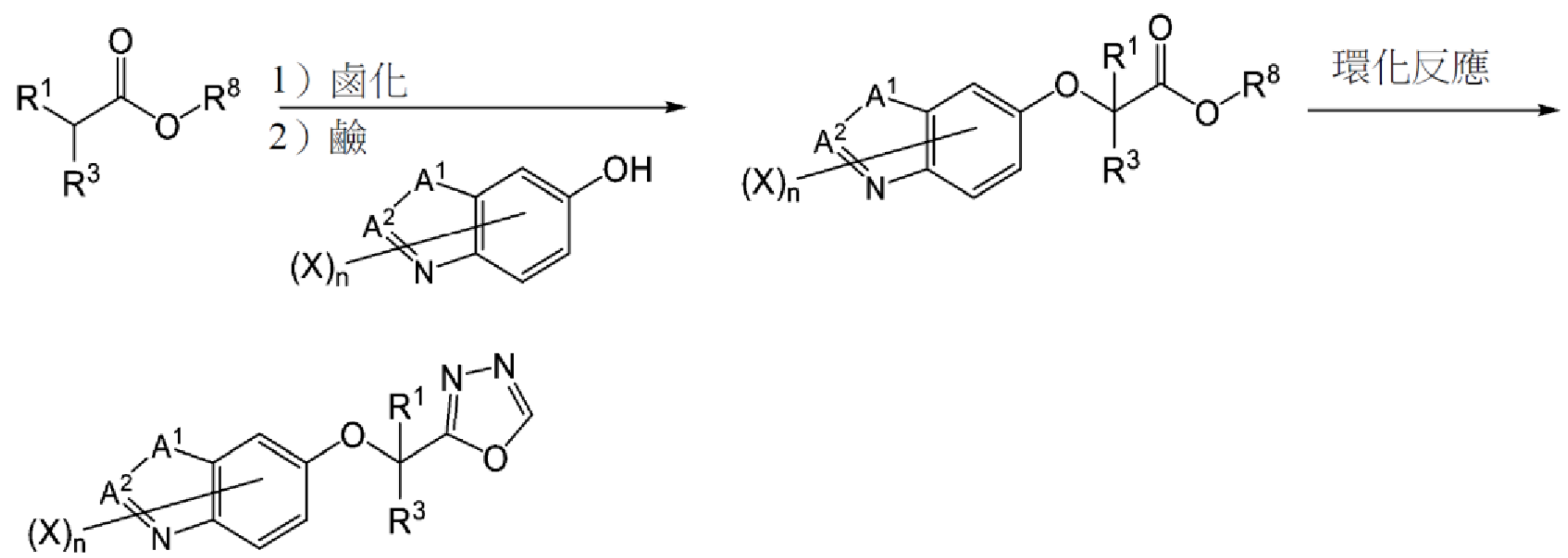
【0118】



【0119】 (式中， R^1 、 R^2 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 X 及 n 為與上述相同之含義)

【0120】 (合成方法2)

【0121】



【0122】 (式中， R^1 、 R^3 、 A^1 、 A^2 、 X 及 n 為與上述相同之含義， R^8 為甲基、乙基等C1-6烷基)

【0123】 [農園藝用殺菌劑]

本發明之農園藝用殺菌劑係含有選自化合物 (I) 或其鹽之至少一種作為有效成分者。本發明之農園藝用殺菌劑中所含之化合物 (I) 或其鹽之量只要顯示殺菌效果，就沒有特別限制。

【0124】 本發明之農園藝用殺菌劑可用於防除源自廣範圍種類之絲狀菌 (例如屬於藻菌類 (Oomycetes)、子囊菌類 (Ascomycetes)、不完全菌類 (Deuteromycetes)、擔子菌類 (Basidiomycetes)、接合菌類 (Zygomycetes) 之菌)

的植物病害。

【0125】 成為防除對象之植物病害（病原菌）之例子如下所示。

甜菜：褐斑病（*Cercospora beticola*）、黑根病（*Aphanomyces cochlioides*）、根腐病（*Thanatephorus cucumeris*）、葉腐病（*Thanatephorus cucumeris*）、銹病（*Uromyces betae*）、白粉病（*Oidium* sp.）、斑點病（*Ramularia beticola*）、苗立枯病（*Aphanomyces cochlioides*、*Pythium ultimum*）等

花生：褐斑病（*Mycosphaerella arachidis*）、污斑病（*Ascochyta* sp.）、銹病（*Puccinia arachidis*）、立枯病（*Pythium debaryanum*）、鏽斑病（*Alternaria alternata*）、白絹病（*Sclerotium rolfsii*）、黑澀病（*Mycosphaerella berkeleyi*）等

黃瓜：白粉病（*Sphaerotheca fuliginea*）、露菌病（*Pseudoperonospora cubensis*）、蔓枯病（*Mycosphaerella melonis*）、萎凋病（*Fusarium oxysporum*）、菌核病（*Sclerotinia sclerotiorum*）、灰黴病（*Botrytis cinerea*）、炭疽病（*Colletotrichum orbiculare*）、黑星病（*Cladosporium cucumerinum*）、褐斑病（*Corynespora cassiicola*）、苗立枯病（*Pythium debaryanum*、*Rhizoctonia solani* Kuhn）、擬莖點黴根腐病（*Phomopsis* sp.）、斑點細菌病（*Pseudomonas syringae* pv. *Lechrymans*）等

蕃茄：灰黴病（*Botrytis cinerea*）、葉黴病（*Cladosporium fulvum*）、疫病（*Phytophthora infestans*）、半身萎凋病（*Verticillium albo-atrum*、*Verticillium dahliae*）、白粉病（*Oidium neolycopersici*）、輪紋病（*Alternaria solani*）、煤黴病（*Pseudocercospora fuligena*）等

茄子：灰黴病（*Botrytis cinerea*）、黑枯病（*Corynespora melongenae*）、白粉病（*Erysiphe cichoracearum*）、煤黴病（*Mycovellosiella nattrassii*）、菌核病（*Sclerotinia sclerotiorum*）、半身萎凋病（*Verticillium dahliae*）、褐紋病（*Phomopsis vexans*）等

草莓：灰黴病（*Botrytis cinerea*）、白粉病（*Sphaerotheca humuli*）、炭疽病（*Colletotrichum acutatum*、*Colletotrichum fragariae*）、疫病（*Phytophthora cactorum*）、軟腐病（*Rhizopus stolonifer*）、萎黃病（*Fusarium oxysporum*）、萎凋病（*Verticillium dahliae*）等

洋蔥：灰色腐敗病（*Botrytis allii*）、灰黴病（*Botrytis cinerea*）、白斑葉枯病（*Botrytis squamosa*）、露菌病（*Peronospora destructor*）、白色疫病（*Phytophthora porri*）、小菌核病（*Ciborinia allii*）等

蔥：軟腐病（*Pectobacterium carotovorum*）、露菌病（*Peronospora destructor*）、葉枯病（*Pleospora allii*）、黑腐菌核病（*Sclerotium cepivorum*）、銹病（*Puccinia allii*）、白斑葉枯病（*Botrytis squamosa*）等

甘藍：根瘤病（*Plasmodiophora brassicae*）、軟腐病（*Erwinia carotovora*）、黑腐病（*Xanthomonas campestris* pv. *campestris*）、黑斑細菌病（*Pseudomonas syringae* pv. *maculicola*、*P. s.* pv. *alisalensis*）、露菌病（*Peronospora parasitica*）、菌核病（*Sclerotinia sclerotiorum*）、黑煤病（*Alternaria brassicicola*）、灰黴病（*Botrytis cinerea*）等

四季豆：菌核病（*Sclerotinia sclerotiorum*）、灰黴病（*Botrytis cinerea*）、炭疽病（*Colletotrichum lindemuthianum*）、角斑病（*Phaeoisariopsis griseola*）等

【0126】 蘋果：白粉病（*Podosphaera leucotricha*）、黑星病（*Venturia inaequalis*）、花腐病（*Monilinia mali*）、黑點病（*Mycosphaerella pomi*）、腐爛病（*Valsa mali*）、斑點落葉病（*Alternaria mali*）、赤星病（*Gymnosporangium yamadae*）、輪紋病（*Botryosphaeria berengeriana*）、炭疽病（*Glomerella cingulata*、*Colletotrichum acutatum*）、褐斑病（*Diplocarpon mali*）、煤點病（*Zygophiala jamaicensis*）、煤斑病（*Gloeodes pomigena*）、紫紋羽病（*Helicobasidium mompa*）、灰黴病（*Botrytis cinerea*）、火傷病（*Erwinia amylovora*）等

梅：黑星病（*Cladosporium carpophilum*）、灰黴病（*Botrytis cinerea*）、褐腐病（*Monilinia mumecola*）、煤斑病（*Peltaster* sp.）等

柿：白粉病（*Phyllactinia kakicola*）、炭疽病（*Gloeosporium kaki*）、角斑落葉病（*Cercospora kaki*）、圓星落葉病（*Mycosphaerella nawae*）等

桃：褐腐病（*Monilinia fructicola*）、黑星病（*Cladosporium carpophilum*）、擬莖點黴腐敗病（*Phomopsis* sp.）、穿孔細菌病（*Xanthomonas campestris* pv. *pruni*）、縮葉病（*Taphrina deformans*）、炭疽病（*Colletotrichum gloeosporioides*）等

杏仁：褐腐病（*Monilinia laxa*）、斑點病（*Stigmina carpophila*）、黑星病（*Cladosporium carpophilum*）、葉腫病（*Polystigma rubrum*）、斑點落葉病（*Alternaria alternata*）、炭疽病（*Colletotrichum gloeosporioides*）等

櫻桃：褐腐病（*Monilinia fructicola*）、炭疽病（*Colletotrichum acutatum*）、黑斑病（*Alternaria* sp.）、幼果菌核病（*Monilinia kusanoi*）、褐色穿孔病（*Mycosphaerella cerasella*）等

葡萄：灰黴病（*Botrytis cinerea*）、白粉病（*Uncinula necator*）、晚腐病（*Glomerella cingulata*、*Colletotrichum acutatum*）、露菌病（*Plasmopara viticola*）、黑痘病（*Elsinoe ampelina*）、褐斑病（*Pseudocercospora vitis*）、黑腐病（*Guignardia bidwellii*）、白腐病（*Coniella castaneicola*）、銹病（*Phakopsora ampelopsidis*）、白色棉雪症（病原菌未鑑定）等

梨：黑星病（*Venturia nashicola*）、赤星病（*Gymnosporangium asiaticum*）、黑斑病（*Alternaria kikuchiana*）、輪紋病（*Botryosphaeria berengeriana*）、白粉病（*Phyllactinia mali*）、胴枯病（*Phomopsis fukushii*）、褐色斑點病（*Stemphylium vesicarium*）、炭疽病（*Glomerella cingulata*）等

茶樹：輪斑病（*Pestalotiopsis longiseta*、*P. theae*）、炭疽病（*Colletotrichum theae-sinensis*）、網餅病（*Exobasidium reticulatum*）等

柑橘：瘡痂病（*Elsinoe fawcettii*）、青黴病（*Penicillium italicum*）、綠黴病（*Penicillium digitatum*）、灰黴病（*Botrytis cinerea*）、黑點病（*Diaporthe citri*）、潰瘍病（*Xanthomonas campestris* pv.*Citri*）、白粉病（*Oidium* sp.）、疫病（*Phytophthora citrophthora*）、炭疽病（*Colletotrichum fioriniae*）等

【0127】 小麥：白粉病（*Blumeria graminis* f.sp. *tritici*）、赤黴病（*Gibberella zeae*）、赤銹病（*Puccinia recondita*）、黃銹病（*Puccinia striiformis*）、褐色雪腐病（*Pythium iwayamai*）、紅色雪腐病（*Monographella nivalis*）、眼斑病（*Pseudocercospora herpotrichoides*）、葉枯病（*Septoria tritici*）、穎枯病（*Leptosphaeria nodorum*）、雪腐小粒菌核病（*Typhula incarnata*）、雪腐大粒菌核病（*Myriosclerotinia borealis*）、立枯病（*Gaeumannomyces graminis*）、麥角病（*Claviceps purpurea*）、腥黑穗病（*Tilletia caries*）、裸黑穗病（*Ustilago nuda*）、稻熱病（*Pyricularia grisea*）等

大麥：斑葉病（*Pyrenophora graminea*）、網斑病（*Pyrenophora teres*）、雲紋病（*Rhynchosporium secalis*）、裸黑穗病（*Ustilago tritici*、*U.nuda*）等

稻：稻熱病（*Pyricularia oryzae*）、紋枯病（*Rhizoctonia solani*）、徒長病（*Gibberella fujikuroi*）、胡麻葉枯病（*Cochliobolus miyabeanus*）、苗立枯病（*Pythium graminicola*）、白葉枯病（*Xanthomonas oryzae*）、苗立枯細菌病（*Burkholderia plantarii*）、褐條病（*Acidovorax avenae*）、穀枯細菌病（*Burkholderia glumae*）、條葉枯病（*Cercospora oryzae*）、稻麴病（*Ustilaginoidea virens*）、褐色米（*Alternaria alternata*、*Curvularia intermedia*）、腹黑米（*Alternaria padwickii*）、紅變米（*Epicoccum purpurascens*）等

菸草：菌核病（*Sclerotinia sclerotiorum*）、白粉病（*Erysiphe cichoracearum*）、疫病（*Phytophthora nicotianae*）、等

鬱金香：灰黴病（*Botrytis cinerea*）等

向日葵：露菌病（*Plasmopara halstedii*）、菌核病（*Sclerotinia sclerotiorum*）、灰黴病（*Botrytis cinerea*）等

小糠草：雪腐大粒菌核病（*Sclerotinia borealis*）、巨斑病（large patch）（*Rhizoctonia solani*）、褐斑病（brown patch）（*Rhizoctonia solani*）、錢斑病（dollar spot）（*Sclerotinia homoeocarpa*）、稻熱病（*Pyricularia* sp.）、赤燒病（*Pythium aphanidermatum*）、炭疽病（*Colletotrichum graminicola*）等

果園草：白粉病（*Erysiphe graminis*）等

大豆：紫斑病（*Cercospora kikuchii*）、露菌病（*Peronospora manshurica*）、莖疫病（*Phytophthora sojae*）、銹病（*Phakopsora pachyrhizi*）、菌核病（*Sclerotinia sclerotiorum*）、炭疽病（*Colletotrichum truncatum*）、灰黴病（*Botrytis cinerea*）、黑痘病（*Elsinoe glycines*）、黑點病（*Diaporthe phaseolorum* var. *sojae*）等

馬鈴薯：疫病（*Phytophthora infestans*）、夏疫病（*Alternaria solani*）、黑痣病（*Thanatephorus cucumeris*）、半身萎凋病（*Verticillium albo-atrum*、*V. dahliae*、*V. nigrescens*）、黑腳病（*Pectobacterium atrosepticum*）、軟腐病（*Pectobacterium carotovorum*）等

香蕉：香蕉黃葉病（Panama disease）（*Fusarium oxysporum*）、香蕉葉斑病（Sigatoka disease）（*Mycosphaerella fijiensis*、*M. musicola*）等

芒果：炭疽病（*Colletotrichum aenigma*）

油菜籽：菌核病（*Sclerotinia sclerotiorum*）、根朽病（*Phoma lingam*）、黑斑病（*Alternaria brassicae*）等

咖啡：銹病（*Hemileia vastatrix*）、炭疽病（*Colletotrichum coffeanum*）、褐眼病（*Cercospora coffeicola*）等

甘蔗：褐銹病（*Puccinia melanocephala*）等

玉米：豹紋病（*Gloeocercospora sorghi*）、銹病（*Puccinia sorghi*）、南方銹病

(*Puccinia polysora*)、黑穗病 (*Ustilago maydis*)、胡麻葉枯病 (*Cochliobolus heterostrophus*)、煤紋病 (*Setosphaeria turcica*) 等

棉：苗立枯病 (*Pythium sp.*)、銹病 (*Phakopsora gossypii*)、白黴病 (*Mycosphaerella areola*)、炭疽病 (*Glomerella gossypii*) 等

【0128】 本發明之農園藝用殺菌劑可列舉穀物類、蔬菜類、根菜類、薯類、樹木類、牧草類、草坪類等。較佳為對穀物類；蔬菜類；根菜類；薯類；果樹類、茶、咖啡、可可等樹木類；牧草類；草坪類；棉花等植物使用。

【0129】 本發明之農園藝用殺菌劑可施用於植物類之各部位，例如葉、莖、柄、花、花蕾、果實、種子、芽、根、塊莖、塊根、苗條、插條等。又，亦可將該等植物類之改良品種、變種、栽培品種、進而突變體、雜交體、基因重組體 (GMO) 作為對象。

【0130】 本發明之農園藝用殺菌劑可用於為了防除產生於包括花卉、草坪、牧草之農園藝作物之各種病害而進行之種子處理、莖葉散布、土壤施用、水面施用等。

【0131】 本發明之農園藝用殺菌劑亦可含有本發明之雜環化合物以外之成分。作為其他成分，可列舉為了製劑化所使用之公知之載體等。又，作為其他成分，可列舉以往公知之殺菌劑、殺蟲殺蟎劑、殺線蟲劑、殺土壤害蟲劑、植物調節劑、協力劑、肥料、土壤改良劑、動物用飼料等。有時藉由含有此種其他成分能發揮協同效應。

【0132】 以下示出可與本發明之農園藝用殺菌劑混用或併用之殺菌劑之具體例。

(1) 核酸生合成抑制劑：

(a) RNA聚合酶I抑制劑：本達樂 (benalaxyl)、右本達樂 (benalaxyl-M)、呋霜靈 (furalaxyl)、滅達樂 (metalaxyl)、右滅達樂 (metalaxyl-M)、歐殺斯

(oxadixyl)、克拉康 (clozylacon)、呋噻胺 (ofurace)；

(b) 腺苷脫胺酶 (adenosine deaminase) 抑制劑：福拉比 (bupirimate)、二甲嘧吩 (dimethirimol)、乙嘧吩 (ethirimol)；

(c) DNA/RNA 合成抑制劑：殺紋寧 (hymexazol)、辛噻酮 (octhilinone)；

(d) DNA 拓樸異構酶 II 抑制劑：歐索林酸 (oxolinic acid)。

【0133】 (2) 有絲核分裂抑制劑及細胞分裂抑制劑：

(a) β -微管蛋白聚合抑制劑：免賴得 (benomyl)、貝芬替 (carbendazim)、苯咪唑菌 (chlorfenazole)、麥穗寧 (fuberidazole)、涕必靈 (thiabendazole)、多保淨 (thiophanate)、甲基多保淨 (thiophanate-methyl)、乙黴威 (diethofencarb)、座賽胺 (zoxamide)、噻唑菌胺 (ethaboxam)；

(b) 細胞分裂抑制劑：賓克隆 (pencycuron)；

(c) 類血影蛋白 (spectrin) 蛋白質之非定域化抑制劑：氟吡菌胺 (fluopicolide)。

【0134】 (3) 呼吸抑制劑：

(a) 複合體 I NADH 氧化還原酵素抑制劑：二氟林 (diflumetorim)、脫芬瑞 (tolfenpyrad)；

(b) 複合體 II 琥珀酸脫氫酵素抑制劑：麥鏽靈 (benodanil)、福多寧 (flutolanil)、滅普寧 (mepronil)、艾索非他滅 (isofetamid)、氟吡菌噻胺 (fluopyram)、甲呋噻胺 (fenfuram)、茂谷樂 (furmecyclox)、萎鏽靈 (carboxin)、嘉保信 (oxycarboxin)、賽氟滅 (thifluzamide)、苯并烯氟菌唑 (benzovindiflupyr)、必殺芬 (bixafen)、氟唑菌噻胺 (fluxapyroxad)、福拉比 (furametpyr)、吡唑萘菌胺 (isopyrazam)、噴福芬 (penflufen)、吡噻菌胺 (penthioapyrad)、氟唑環菌胺 (sedaxane)、白克列 (boscalid)、吡唑氟蟲胺 (pyraziflumid)、氟唑菌噻脛胺 (pydiflumetofen)、異氟吡蘭 (isoflucypram)、氟蟲胺 (inpyrfluxam)；

(c) 複合體III還原型輔酶 (Ubiquinol) 氧化酶Qo抑制劑：亞托敏 (azoxystrobin)、丁香菌酯 (coumoxystrobin)、甲香菌酯 (coumethoxystrobin)、烯肱菌酯 (enoxastrobin)、氟菌蟎酯 (flufenoxystrobin)、啖氧菌酯 (picoxystrobin)、唑菌酯 (pyraoxystrobin)、百克敏 (pyraclostrobin)、唑胺菌酯 (pyrametostrobin)、三環吡菌威 (triclopyricarb)、克收欣 (kresoxim-methyl)、三氟敏 (trifloxystrobin)、醚菌胺 (dimoxystrobin)、烯肱菌胺 (fenaminstrobin)、苯氧菌胺 (metominostrobin)、肱醚菌胺 (orysastrobin)、凡殺同 (famoxadone)、氟嘧菌酯 (fluoxastrobin)、咪唑菌酮 (fenamidone)、吡菌苯威 (pyribencarb)、mandestrobin、metyltetraprole；

(d) 複合體III還原型輔酶還原酵素Qi抑制劑：賽座滅 (cyazofamid)、安美速 (amisulbrom)、芬比沙米 (fenpicoxamid)；

(e) 氧化性磷酸化解偶聯劑：百蟎克 (binapacryl)、消蟎多 (meptyldinocap)、白粉克 (dinocap)、扶吉胺 (fluazinam)、富米綜 (ferimzone)；

(f) 氧化性磷酸化抑制劑 (ATP合成酵素之抑制劑)：三苯醋錫 (fentin acetate)、三苯氯錫 (fentin chloride)、三苯羥錫 (fentin hydroxide)；

(g) ATP生產抑制劑：硫矽菌胺 (silthiofam)；

(h) 複合體III：細胞色素bc1 (泛醌還原酵素) 之Qx (未知) 抑制劑：辛唑嘧菌胺 (ametocetradin)。

【0135】 (4) 胺基酸及蛋白質合成抑制劑

(a) 甲硫胺酸生合成抑制劑：胺撲滅 (andoprim)、賽普洛 (cyprodinil)、滅派林 (mepanipyrim)、派美尼 (pyrimethanil)；

(b) 蛋白質合成抑制劑：殺稻瘟菌素 (blasticidin) -S、嘉賜黴素 (kasugamycin)、鹽酸嘉賜黴素 (kasugamycin hydrochloride)、鏈黴素 (streptomycin)、土黴素 (oxytetracycline)。

【0136】 (5) 訊號傳遞抑制劑：

(a) 訊號傳遞抑制劑：快諾芬 (quinoxifen)、丙氧喹啉 (proquinazid)；

(b) 滲透壓訊號傳遞中之MAP/組胺酸激酶抑制劑：拌種咯 (fenpiclonil)、護汰寧 (fludioxonil)、克氯得 (chlozolate)、依普同 (iprodione)、撲滅寧 (procymidone)、免克寧 (vinclozolin)。

【0137】 (6) 脂質及細胞膜合成抑制劑：

(a) 磷脂質生合成、甲基轉移酶抑制劑：護粒松 (edifenphos)、丙基喜樂松 (iprobenfos)、白粉松 (pyrazophos)、亞賜圃 (isoprothiolane)；

(b) 脂質之過氧化劑：聯苯 (biphenyl)、地茂散 (chloroneb)、大克爛 (dicloran)、五氯硝基苯 (quintozene)、四氯硝基苯 (tecnazene)、脫克松 (tolclofos-methyl)、依得利 (etridiazole)；

(c) 作用於細胞膜之藥劑：碘代丙炔基丁基甲胺酸酯 (iodocarb)、霜黴威 (propamocarb)、鹽酸霜黴威 (propamocarb-hydrochloride)、乙膦酸霜黴威 (propamocarb-fosetyl)、胺丙威 (prothiocarb)；

(d) 干擾病原菌細胞膜之微生物：枯草桿菌 (bacillus subtilis)、枯草桿菌 QST713株 (bacillus subtilis strain QST713)、枯草桿菌FZB24株 (bacillus subtilis strain FZB24)、枯草桿菌MBI600株 (bacillus subtilis strain MBI600)、枯草桿菌 D747株 (bacillus subtilis strain D747)、芽孢枯草桿菌 (bacillus amyloliquefaciens)；

(e) 干擾細胞膜之藥劑：互生葉白千層 (茶樹) 之萃取物 (melaleuca alternifolia (tea tree) extract)。

【0138】 (7) 細胞膜之固醇生合成抑制劑：

(a) 固醇生合成中之C14位之去甲基化抑制劑：賽福寧 (triforine)、比芬諾 (pyrifenox)、啖菌嘮唑 (pyrisoxazole)、芬瑞莫 (fenarimol)、呋嘮醇 (flurprimidol)、尼瑞莫 (nuarimol)、依滅列 (imazalil)、硫酸依滅列 (imazalil-sulphate)、富馬酸嘮咪唑 (oxpoconazole fumarate)、稻瘟酯 (pefurazoate)、撲克拉 (prochloraz)、

賽福座 (triflumizole)、烯霜苳唑 (viniconazole)、阿紮康唑 (azaconazole)、比多農 (bitertanol)、溴克座 (bromuconazole)、環克座 (cyproconazole)、苳氯三唑醇 (diclobutrazol)、待克利 (difenoconazole)、達克利 (diniconazole)、右達克利 (diniconazole-M)、依普座 (epoxiconazole)、乙環唑 (etaconazole)、芬克座 (fenbuconazole)、氟喹唑 (fluquinconazole)、護矽得 (flusilazole)、護汰芬 (flutriafol)、呋菌唑 (furconazole)、順式呋菌唑 (furconazole-cis)、菲克利 (hexaconazole)、易胺座 (imibenconazole)、種菌唑 (ipconazole)、滅特座 (metconazole)、邁克尼 (myclobutanil)、平克座 (penconazole)、普克利 (propiconazole)、氟喹唑 (fluquinconazole)、矽氟唑 (simeconazole)、得克利 (tebuconazole)、四克利 (tetraconazole)、三泰芬 (triadimefon)、三泰隆 (triadimenol)、滅菌唑 (triticonazole)、丙硫菌唑 (prothioconazole)、伏立康唑 (voriconazole)、氯氟醚菌唑 (mefentrifluconazole)；

(b) 固醇生合成中之 $\Delta 14$ 還原酵素及 $\Delta 8 \rightarrow \Delta 7$ -異構酶之抑制劑：

十二嗎啉 (aldimorph)、嗎菌靈 (dodemorph)、嗎菌靈乙酸鹽、芬普福 (fenpropimorph)、三得芬 (tridemorph)、苯鏽啖 (fenpropidin)、粉病靈 (piperalin)、甚孢菌素 (spiroxamine)；

(c) 固醇生合成系之C4位去甲基化中之3-酮還原酵素抑制劑：環醯菌胺 (fenhexamid)、胺苯吡菌酮 (fenpyrazamine)；

(d) 固醇生合成系之角鯊烯環氧酶抑制劑：稗草畏 (pyributicarb)；萘替芬 (naftifine)、特比萘芬 (terbinafine)。

【0139】 (8) 細胞壁合成抑制

(a) 海藻糖酶 (trehalase) 抑制劑：維利黴素 (validamycin)；

(b) 甲殼素合成酵素抑制劑：多氧菌素 (polyoxin)、保粒黴素丁 (polyoxorim)；

(c) 纖維素合成酵素抑制劑：達滅芬 (dimethomorph)、氟嗎啉 (flumorph)、丁吡嗎啉 (pyrimorph)、異丙基苯噻菌胺 (benthiavalicarb-isopropyl)、籲黴威 (iprovalicarb)、維利芬那 (valifenalate)、曼普胺 (mandipropamid)。

【0140】 (9) 黑色素生合成抑制劑

(a) 黑色素生合成之還原酵素抑制劑：四氯苯酞 (fthalide)、百快隆 (pyroquilon)、三賽唑 (tricyclazole)；

(b) 黑色素生合成之脫水酵素抑制劑：加普胺 (carpropamid)、二氯西莫 (diclocymet)、芬諾尼 (fenoxanil)；

(C) 黑色素生合成之聚酮化合物 (polyketide) 合成抑制劑：異丙威 (tolprocarb)。

【0141】 (10) 宿主植物之抗性誘導劑：

(a) 作用於水楊酸合成路徑之藥劑：酸化苯并噻二唑-S-甲酯 (acibenzolar-S-methyl)；

(b) 其他：撲殺熱 (probenazole)、噻醯菌胺 (tiadinil)、異噻菌胺 (isotianil)、dichlobentiazox、昆布醣 (laminarin)、大虎杖萃取液 (reynoutria sachalinensis extract)。

【0142】 (11) 作用性不明之藥劑：克絕 (cymoxanil)、三乙膦酸鋁 (fosetyl-aluminium)、磷酸 (磷酸鹽) (phosphoric acid (phosphate))、克枯爛 (tecloftalam)、咪唑吡 (triazoxide)、氟硫滅 (flusulfamide)、達滅淨 (diclomezine)、滅速克 (methasulfocarb)、環氟菌胺 (cyflufenamid)、滅芬農 (metrafenone)、哌瑞芬酮 (pyriofenone)、多果定 (dodine)、多果定自由鹼 (dodine free base)、氟替尼 (flutianil)。

【0143】 (12) 具有多作用點之藥劑：銅 (銅鹽) (copper (copper salt))、波爾多液 (bordeaux mixture)、氫氧化銅 (copper hydroxide)、萘二甲酸銅 (copper

naphthalate)、氧化銅 (copper oxide)、氧氯化銅 (copper oxychloride)、硫酸銅 (copper sulfate)、硫 (sulfur)、硫製品 (sulfur product)、多硫化鈣 (calcium polysulfide)、福美鐵 (ferbam)、代森鋅錳 (mancozeb)、錳乃浦 (maneb)、銅錳乃浦 (mancopper)、免得爛 (metiram)、代森福美鋅 (polycarbamate)、甲基鋅乃浦 (propineb)、得恩地 (thiram)、鋅乃浦 (zineb)、福美鋅 (ziram)、蓋普丹 (captan)、四氯丹 (captafol)、福爾培 (folpet)、四氯異苯 (chlorothalonil)、益發靈 (dichlofluanid)、託福寧 (tolyfluanid)、克熱淨 (guazatine)、克熱淨乙酸鹽 (iminoctadine triacetate)、克熱淨烷苯磺酸鹽 (iminoctadine trialbesilate)、敵菌靈 (anilazine)、腈硫醃 (dithianon)、甲基克殺蟎 (quinomethionate)、氟美地 (fluoroimide)。

【0144】 (13) 其他藥劑：DBEDC、氟佛配特 (fluorofolpet)、雙胍乙酸鹽 (guazatine acetate)、雙(8-羥基喹啉)銅(II) (bis (8-quinolinolato) copper(II))、普羅帕脒 (propamidine)、氯化苦 (chloropicrin)、酯菌胺 (cyprofuram)、農桿菌 (agrobacterium)、3-苯并[b]噻吩-2-基-5,6-二氫-1,4,2-噻吡4-氧化物 (bethoxazin)、二苯胺 (diphenylamine)、異硫氰酸甲酯 (MITC) (methyl isothiocyanate)、滅粉黴素 (mildiomycin)、辣椒鹼 (capsaicin)、硫雜靈 (cufraneb)、噻普磺醃胺 (cyprosulfamide)、邁隆 (dazomet)、咪菌威 (debacarb)、二氯酚 (dichlorophen)、氟美醃胺 (flumetover)、三乙膦酸鈣 (fosetyl-calcium)、三乙膦酸鈉 (fosetyl-sodium)、人間黴素 (irimamycin)、遊黴素 (natamycin)、異丙消 (nitrothal isopropyl)、惡莫克 (oxamocarb)、硝吡咯菌素 (pyrrolnitrin)、喹啉類殺真菌劑 (tebufloquin)、甲磺菌胺 (tolnifanide)、氰菌胺 (zarilamide)、algophase、拌種靈 (amicarthiazol)、奧賽普林 (oxathiapiprolin)、代森聯鋅 (metiram zinc)、苯噻唑 (benthiazole)、水楊菌胺 (trichlamide)、烯效唑 (uniconazole)、氧代奮欣 (oxyfenthiin)、皮卡布西 (picarbutrazox)、dichlobentiazox、噻諾富林

(quinofumelin)、秋蘭姆(thiuram)、代森銨(ambam)、土壤放射桿菌(agrobacterium radiobacter)、盾殼黴(coniothyrium minitans)、螢光假單孢菌(pseudomonas fluorescens)、假單孢菌(pseudomonas rhodesiae)、黃色蠕形黴(talaromyces flavus)、深綠木黴(trichoderma atroviride)、非病原性軟腐病菌(erwinia carotovora subsp. carotovora)、簡單芽孢桿菌(bacillus simplex)、爭論產鹼菌(variovorax paradoxus)、植物乳桿菌(lactobacillus plantarum)、florylpicoxamid、pyrapropoyne、氟茚唑菌胺(fluidapyr)、aminopyrifen、pyridachlometyl、ipflufenquin。

【0145】 以下示出可與本發明之農園藝用殺菌劑混用或併用之殺蟲/殺蟎劑、殺線蟲劑、殺土壤害蟲劑、驅蟲劑等之具體例。

【0146】 (1) 乙醯膽鹼酯酶抑制劑：

(a) 胺甲酸酯系：棉靈威(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、免敵克(bendiocarb)、免扶克(benfuracarb)、丁酮威(butocarboxim)、丁酮磯威(butoxycarboxim)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、愛芬克(ethiofencarb)、丁基滅必虱(fenobucarb)、覆滅蟎(formetanate)、呋線威(furathiocarb)、異丙威(isoprocab)、滅賜克(methiocarb)、納乃得(methomyl)、歐殺滅(oxamyl)、比加普(pirimicarb)、安丹(propoxur)、硫敵克(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、啞蚱威(triazamate)、混殺威(trimethacarb)、XMC、滅爾虱(xylylcarb)、芬硫克(fenothiocarb)、滅必虱(MIPC)、滅爾蝨(MPMC)、速滅威(MTMC)、磯滅威(aldoxycarb)、除害威(allyxycarb)、安美加(aminocarb)、必克虱(bufencarb)、除線威(cloethocarb)、斯美地(metam-sodium)、普滅克(promecarb)；

【0147】 (b) 有機磷系：歐殺松(acephate)、亞滅松(azamethiphos)、乙基谷速松(azinphos-ethyl)、甲基谷速松(azinphos-methyl)、硫線磷(cadusafos)、

氯氧磷 (chlorethoxyfos)、克芬松 (chlorfenvinphos)、氯甲磷 (chlormephos)、陶
 斯松 (chlorpyrifos)、甲基陶斯松 (chlorpyrifos-methyl)、牛壁逃 (coumaphos)、
 氰乃松 (cyanophos)、滅賜松 (demeton-S-methyl)、大利松 (diazinon)、二氯松
 (dichlorvos) /DDVP、雙特松 (dicrotophos)、大滅松 (dimethoate)、甲基毒蟲
 畏 (dimethylvinphos)、二硫松 (disulfoton)、EPN、愛殺松 (ethion)、普伏松
 (ethoprophos)、胺磺磷 (famphur)、芬滅松 (fenamiphos)、撲滅松 (fenitrothion)、
 芬殺松 (fenthion)、福賽絕 (fosthiazate)、飛達松 (heptenophos)、菸鹼硫磷
 (imicyafos)、亞芬松 (isofenphos)、水胺硫磷 (isocarbophos)、加福松 (isoxathion)、
 馬拉松 (malathion)、滅加松 (mecarbam)、達馬松 (methamidophos)、滅大松
 (methidathion)、美文松 (mevinphos)、亞素靈 (monocrotophos)、乃力松 (naled)、
 歐滅松 (omethoate)、滅多松 (oxydemeton-methyl)、巴拉松 (parathion)、甲基
 巴拉松 (parathion-methyl)、賽達松 (phenthoate)、福瑞松 (phorate)、裕必松
 (phosalone)、益滅松 (phosmet)、福賜米松 (phosphamidon)、辛硫磷 (phoxim)、
 亞特松 (pirimiphos-methyl)、布飛松 (profenofos)、撲達松 (propetamphos)、普
 硫松 (prothiofos)、白克松 (pyraclofos)、必芬松 (pyridaphenthion)、拜裕松
 (quinalphos)、硫特普 (sulfotep)、嘧丙磷 (tebupirimfos)、亞培松 (temephos)、
 託福松 (terbufos)、樂本松 (tetrachlorvinphos)、硫滅松 (thiometon)、三落松
 (triazophos)、三氯松 (trichlorfon)、繁米松 (vamidothion)；乙基溴磷松
 (bromophos-ethyl)、BRP、加芬松 (carbophenothion)、施力松 (cyanofenphos)、
 CYAP、滅賜松磺 (demeton-S-methyl sulfone)、得拉松 (dialifos)、氯線磷
 (dichlofenthion)、殺力松 (dioxabenzofos)、益多松 (etrimfos)、繁福松
 (fensulfothion)、吡氟硫磷 (flupyrzofos)、大福松 (fonofos)、安果 (formothion)、
 丁苯硫磷 (fosmethilan)、依殺松 (isazofos)、阿發松 (jodfenphos)、滅克松
 (methacrifos)、乙基亞特松 (pirimiphos-ethyl)、磷蟲威 (phosphocarb)、丙蟲磷

(propaphos)、飛克松 (prothoate)、乙丙硫磷 (sulprofos)。

【0148】 (2) GABA-功能性氯離子通道拮抗劑：乙醯蟲腈 (acetoprole)、氯丹 (chlordane)、安殺番 (endosulfan)、乙蟲清 (ethiprole)、芬普尼 (fipronil)、氟蟲腈 (pyrafluprole)、派瑞樂 (pyriprole)、毒殺芬 (camphechlor)、飛布達 (heptachlor)、得氯蟎 (dienochlor)。

(3) 鈉離子通道調節劑：阿納寧 (acrinathrin)、右旋亞列寧 (d-cis-trans allethrin)、右旋反式亞列寧 (d-trans allethrin)、畢芬寧 (bifenthrin)、百亞列寧 (bioallethrin)、百亞列寧S-環戊基異構物 (bioallethrin s-cyclopentyl isomer)、百列滅寧 (bioresmethrin)、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、賽扶寧 (cyfluthrin)、β-賽扶寧 (β-cyfluthrin)、賽洛寧 (cyhalothrin)、λ-賽洛寧 (λ-cyhalothrin)、γ-賽洛寧 (γ-cyhalothrin)、賽滅寧 (cypermethrin)、亞滅寧 (α-cypermethrin)、β-賽滅寧 (β-cypermethrin)、θ-賽滅寧 (θ-cypermethrin)、ζ-賽滅寧 (ζ-cypermethrin)、賽酚寧 [(1R)-反式異構物] (cyphenothrin [(1R)-trans isomer])、第滅寧 (deltamethrin)、益避寧 [(EZ)-(1R)-異構物] (Empenthrin[(EZ)-(1R)-Isomer])、益化利 (esfenvalerate)、依芬寧 (etofenprox)、芬普寧 (fenpropathrin)、芬化利 (fenvalerate)、護賽寧 (flucythrinate)、氟氯苯菊酯 (flumethrin)、τ-福化利 (τ-fluvalinate)、合芬寧 (halfenprox)、依普寧 (imiprothrin)、克特寧 (kadethrin)、百滅寧 (permethrin)、酚丁滅虱 [(1R)-反式異構物] (phenothrin [(1R)-trans isomer])、普亞列寧 (prallethrin)、除蟲菊酯 (pyrethrum)、列滅寧 (resmethrin)、矽護芬 (silafuofen)、七氟菊酯 (tefluthrin)、治滅寧 [(1R)-異構物] (tetramethrin [(1R)-isomer])、泰滅寧 (tralomethrin)、拜富寧 (transfluthrin)、亞列寧 (allethrin)、除蟲菊精 (pyrethrin)、除蟲菊精I (pyrethrin I)、除蟲菊精II (pyrethrin II)、丙氟菊酯 (profluthrin)、四氟甲醚菊酯 (dimefluthrin)、生物環呋菊酯 (bioethanomethrin)、生物氯菊酯 (biopermethrin)、反式百滅寧 (transpermethrin)、五氟苯菊酯 (fenfluthrin)、吡

氯氰菊酯 (fenpirithrin)、溴氰菊酯 (flubrocyclothrinate)、三氟醚菊酯 (flufenprox)、美特寧 (metofluthrin)、丙三苯醚菊酯 (protrifenbute)、皮苳呋菊酯 (pyresmethrin)、環戊烯丙菊酯 (terallethrin)。

【0149】 (4) 菸鹼性乙醯膽鹼受體促效劑：亞滅培 (acetamiprid)、可尼丁 (clothianidin)、達特南 (dinotefuran)、益達胺 (imidacloprid)、烯啶蟲胺 (nitenpyram)、硝蟲噻吡 (nithiazine)、賽果培 (thiacloprid)、賽滅速殺 (thiamethoxam)、氟啶蟲胺脒 (sulfoxaflor)、菸鹼 (nicotine)、4-[(6-氯-3-吡啶基甲基)(2,2-二氟乙基)胺基]呋喃-2(5H)-酮 (flupyradifurone)、flupyrimine。

(5) 菸鹼性乙醯膽鹼受體異位調節劑 (allosteric modulator)：賜諾特 (spinetoram)、賜諾殺 (spinosad)。

(6) 氯化物通道活化劑：阿巴汀 (abamectin)、因滅汀 (emamectin-benzoate)、林皮沒丁 (lepimectin)、密滅汀 (milbemectin)、害獲滅 (ivermectin)、色拉菌素 (selamectin)、多拉菌素 (doramectin)、依普菌素 (eprinomectin)、莫西菌素 (moxidectin)、殺蟎菌素 (milbemycin)、殺蟎菌素肟 (milbemycin oxime)、奈馬克丁 (nemadectin)。

(7) 保幼激素類似物：烯蟲乙酯 (hydroprene)、烯蟲炔酯 (kinoprene)、美賜平 (methoprene)、芬諾克 (fenoxycarb)、百利普芬 (pyriproxyfen)、苯蟲醚 (diofenolan)、保幼醚 (epofenonane)、烯蟲硫酯 (triprene)。

(8) 其他非特異性抑制劑：溴甲烷 (methyl bromide)、氯化苦 (chloropicrin)、磺酰氟 (sulfuryl fluoride)、硼砂 (borax)、吐酒石 (tartar emetic)。

(9) 同翅目選擇性攝食抑制劑：氟尼尼胺 (flonicamid)、派滅淨 (pymetrozine)、新啞啞啞 (pyrifluquinazon)。

【0150】 (10) 蟎類生育抑制劑：克芬蟎 (clofentezine)、氟蟎吡 (diflovidazin)、合賽多 (hexythiazox)、依殺蟎 (etoxazole)。

(11) 微生物源昆蟲中腸內膜破壞劑：蘇力菌以色列亞種 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *Israelensis*)、球形桿菌 (*Bacillus sphaericus*)、蘇力菌鯰澤亞種 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *Aizawai*)、蘇力菌庫斯克亞種 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *Kurstaki*)、蘇力菌擬步行亞種 (*Bacillus thuringiensis* subsp. *Tenebrionis*)、Bt作物蛋白質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/Cry35Ab1。

(12) 粒線體ATP生合成酵素抑制劑：汰芬諾克 (*diafenthiuron*)、亞環錫 (*azocyclotin*)、錫蟎丹 (*cyhexatin*)、芬布錫 (*fenbutatin oxide*)、歐蟎多 (*propargite*)、得脫蟎 (*tetradifon*)。

(13) 氧化性磷酸化解偶聯劑 (*uncoupling agent*)：克凡派 (*chlorfenapyr*)、氟蟲胺 (*sulfluramid*)、DNOC、百蟎克 (*binapacryl*)、大脫蟎 (*dinobuton*)、白粉克 (*dinocap*)。

(14) 菸鹼性乙醯膽鹼受體通道阻斷劑：免速達 (*bensultap*)、培丹鹽酸鹽 (*cartap hydrochloride*)、沙蠶毒素 (*nereistoxin*)、殺蟲單 (*thiosultap-sodium*)、硫賜安 (*thiocyclam*)。

(15) 甲殼素合成抑制劑：雙三氟蟲脲 (*bistrifluron*)、克福隆 (*chlorfluazuron*)、二福隆 (*diflubenzuron*)、氟環脲 (*flucycloxuron*)、氟芬隆 (*flufenoxuron*)、六福隆 (*hexaflumuron*)、祿芬隆 (*lufenuron*)、諾伐隆 (*novaluron*)、諾福隆 (*noviflumuron*)、得福隆 (*teflubenzuron*)、三福隆 (*triflumuron*)、布芬淨 (*buprofezin*)、氟佐隆 (*fluazuron*)。

(16) 雙翅目蛻皮干擾劑：賽滅淨 (*cyromazine*)。

(17) 蛻皮激素受體促效劑：可芬諾 (*chromafenozide*)、合芬隆 (*halofenozide*)、滅芬諾 (*methoxyfenozide*)、得芬諾 (*tebufenozide*)。

(18) 章魚胺受體促效劑：三亞蟎 (*amitraz*)、得米地曲 (*demiditraz*)、殺

蟲脒（chlordimeform）。

（19）粒線體電子傳遞系統複合體III抑制劑：亞醌蟎（acequinocyl）、嘧蟎酯（fluacrypyrim）、愛美松（hydramethylnon）。

（20）粒線體電子傳遞系統複合體I抑制劑：芬殺蟎（fenazaquin）、芬普蟎（fenpyroximate）、畢汰芬（pyrimidifen）、比達本（pyridaben）、得芬瑞（tebufenpyrad）、脫芬瑞（tolfenpyrad）、魚藤酮（rotenone）。

【0151】（21）電位依賴性鈉離子通道阻斷劑：因得克（indoxacarb）、美氟綜（metaflumizone）。

（22）乙醯輔酶A羧化酶抑制劑：賜派芬（spirodiclofen）、螺甲蟎酯（spiromesifen）、賜派滅（spirotetramat）。

（23）粒線體電子傳遞系統複合體IV抑制劑：磷化鋁（aluminium phosphide）、磷化鈣（calcium phosphide）、磷（phosphine）、磷化鋅（zinc phosphide）、氰化物（cyanide）。

（24）粒線體電子傳遞系統複合體II抑制劑：啞蟎氰（cyenopyrafen）、丁氟蟎酯（cyflumetofen）、pyflubumide。

（25）利阿諾定（Ryanodine）受體調節劑：克安勃（chlorantraniliprole）、氰蟲醯胺（cyantraniliprole）、氟苯蟲醯胺（flubendiamide）、環溴蟲醯胺（cyclaniliprole）、氟氰蟲醯胺（tetraniliprole）。

（26）混合功能氧化酶抑制劑化合物：協力精（piperonyl butoxide）。

（27）蛛毒素（latrophilin）受體作用藥：酯肽（depsipeptide）、環狀酯肽（cyclodepsipeptide）、24員環狀酯肽（24 membered cyclodepsipeptide）、艾莫德斯（emodepside）。

（28）其他藥劑（作用機制未知）：印棟素（azadirachtin）、西脫蟎（benzoximate）、必芬蟎（bifenazate）、新殺蟎（bromopropylate）、滅蟎猛

(quinomethionate)、冰晶石(cryolite)、大克蟎(dicofol)、啖蟲丙醚(pyridalyl)、苯氯噻吡(benclothiaz)、硫(sulfur)、磺胺蟎酯(amidoflumet)、1,3-二氯丙烯(1,3-dichloropropene)、DCIP、溴蟎酯(phenisobromolate)、苯蟎特(benzomate)、聚乙醛(metaldehyde)、克氯苯(chlorobenzilate)、氯噻唑(clothiazoben)、環蟲腈(dicyclanil)、氧嘧醯胺(fenoxacrim)、氟硝二苯胺(fentrifanil)、氟苯滅(flubenzimine)、氟芬那辛(fluphenazine)、紅鈴蟲性誘素(gossyplure)、金龜子性誘素(japonilure)、啞蟲酮(metoxadiazone)、石油(oil)、油酸鉀(potassium oleate)、殺蟎好(tetrasul)、苯蟎噻(triarathene)、雙丙環蟲酯(afidopyropen)、flometoquin、丁烯氟蟲腈(flufiprole)、氟磺靈(fluensulfone)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、四氟醚菊酯(tetramethylfluthrin)、溴代吡咯腈(tralopyril)、四氟甲醚菊酯(dimefluthrin)、甲基新癸醯胺(methylneodecanamide)、氟雷拉納(fluralaner)、阿福拉納(afoxolaner)、氟啞唑醯胺(fluxametamide)、5-[5-(3,5-二氯苯基)-5-三氟甲基-4,5-二氫異啞唑-3-基]-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)苯甲腈(CAS : 943137-49-3) (5-[5-(3,5-dichlorophenyl)-5-trifluoromethyl-4,5-dihydroisoxazole-3-yl]-2-(1H-1,2,4-triazole-1-yl)benzonitrile (CAS:943137-49-3))、溴蟲氟苯雙醯胺(broflanilide)、其他間位二醯胺類(meta-diamide)、小卷蛾斯氏線蟲(steinernema carpocapsae)、格氏線蟲(steinernema glaseri)、穿刺巴氏桿菌(pasteuria penetrans)、細腳擬青黴(paecilomyces tenuipes)、玫煙色擬青黴(paecilomyces fumosoroseus)、球孢白僵菌(beauveria bassiana)、布氏白僵菌(beauveria brongniartii)、金龜子綠僵菌(metarhizium anisopliae)、蠟蚧輪枝菌(verticillium lecanii)、acynonapyr。

【0152】 (29) 驅蟲劑：

(a) 苯并咪唑系：芬苯達唑(fenbendazole)、阿苯達唑(albendazole)、三氯苯達唑(triclabendazole)、奧苯達唑(oxibendazole)、甲苯達唑(mebendazole)、

奧芬達唑（oxfendazole）、帕苯達唑（parbendazole）、氟苯達唑（flubendazole）、
苯硫胍（febantel）、奈托比胺（netobimin）、多保淨（thiophanate）、腐絕
（thiabendazole）、坎苯達唑（cambendazole）；

（b）柳醯胺苯系：氯氰磺柳胺（closantel）、氯羥柳胺（oxyclozanide）、碘
醚柳胺（rafoxanide）、氯硝柳胺（niclosamide）；

（c）取代酚系：硝羥碘苳腈（nitroxynil）、硝異硫氰二苯醚（nitroscanate）；

（d）嘧啶系：抗蟲靈（pyrantel）、摩朗得（morantel）；

（e）咪唑并噻唑系：左旋咪唑（levamisole）、四咪唑（tetramisole）；

（f）四氫嘧啶系：吡喹酮（praziquantel）、依西太爾（epsiprantel）；

（g）其他驅蟲藥：環戊二烯類（cyclodiene）、雷雅尼雅（ryania）、氯舒隆
（clorsulon）、甲硝噻唑（metronidazole）、得米地曲（demiditraz）、哌啉（piperazine）、
乙胺哌（diethylcarbamazine）、雙氯酚（dichlorophen）、莫奈太爾砒（monepantel）、
三苯雙脒（tribendimidine）、阿米登太（amidantel）、硫乙肫胺（thiacetarsamide）、
美拉索明（melarsomine）、硫乙肫胺酸（arsenamide）。

【0153】 以下示出可與本發明之農園藝用殺菌劑混用或併用之植物調節
劑之具體例。

脫落酸（abscisic acid）、激動素（kinetin）、苳基胺基嘌呤（Benzylaminopurine）、
1,3-二苯基脲（1,3-diphenylurea）、氯吡脲（forchlorfenuron）、噻苯隆（thidiazuron）、
福芬素（chlorfenuron）、二氫玉米素（dihydrozeatin）、吉貝素A（gibberellin A）、
吉貝素A4（gibberellin A4）、吉貝素A7（gibberellin A7）、吉貝素A3（gibberellin
A3）、1-甲基環丙烷（1-methylcyclopropane）、N-乙醯胺基乙氧基乙烯基甘胺酸
（別名：四烯雌酮）（N-acetyl aminoethoxyvinyl glycine（aviglycine））、胺基氧基
乙酸（aminooxyacetate）、硝酸銀（silver nitrate）、氯化鈷（cobalt chloride）、IAA、
4-CPA、果美生長素（cloprop）、2,4-D、MCPB、吲哚-3-丁酸（indole-3-butyrate）、

2,4-滴丙酸 (dichlorprop)、酚硫殺 (phenothiol)、1-萘基乙醯胺 (1-naphthyl acetamide)、吲熟酯 (ethychlozate)、座果酸 (cloxyfonac)、馬來醯肼 (maleic acid hydrazide)、2,3,5-三碘苯甲酸 (2,3,5-triiodobenzoic acid)、水楊酸 (salicylic acid)、水楊酸甲酯 (methyl salicylate)、(-)-茉莉酸 ((-)-jasmonic acid)、茉莉酸甲酯 (methyl jasmonate)、(+)-獨腳金醇 ((+)-strigol)、(+)-去氧獨腳金醇 ((+)-deoxystrigol)、(+)-列當醇 ((+)-orobanchol)、(+)-高粱內酯 ((+)-sorgolactone)、4-側氧基-4-(2-苯基乙基)胺基丁酸 (4-oxo-4-(2-phenylethyl)aminobutyric acid)、益收生長素 (ethephon)、克美素 (chlormequat)、縮節胺 (mepiquat chloride)、苄基腺嘌呤 (benzyladenine)、5-胺基乙醯丙酸 (5-amino levulinic acid)、亞拉生長素 (daminozide)。

【0154】 [製劑配方]

本發明之農園藝用殺菌劑並不受劑型特別限定。例如，可列舉水合劑、乳劑、粉劑、粒劑、水溶劑、懸浮劑、顆粒水合劑、錠劑等劑型。製備製劑之方法並無特別限制，可根據劑形採用公知之製備方法。

以下，示出若干製劑實施例。再者，以下所示出之製劑配方僅為例示，可於不違反本發明之主旨之範圍內進行修正，本發明並不受以下製劑實施例任何限制。「份」只要無特別說明，則表示「質量份」。

【0155】 (製劑1：水合劑)

將本發明之雜環化合物40份、矽藻土53份、高級醇硫酸酯4份、及烷基萘磺酸鹽3份均勻混合而微細地粉碎，獲得有效成分為40質量%之水合劑。

【0156】 (製劑2：乳劑)

將本發明之雜環化合物30份、二甲苯33份、二甲基甲醯胺30份、及聚氧乙烯烷基烯丙基醚7份混合並溶解，獲得有效成分為30質量%之乳劑。

【0157】 (製劑3：粒劑)

將本發明之雜環化合物5份、滑石40份、黏土38份、膨潤土10份、及烷基硫酸鈉7份均勻混合而微細地粉碎後，造粒為直徑0.5～1.0 mm之粒狀而獲得有效成分為5質量%之粒劑。

【0158】 （製劑4：粒劑）

將本發明之雜環化合物5份、黏土73份、膨潤土20份、磺基丁二酸二辛酯鈉鹽1份、及磷酸鉀1份充分粉碎混合，添加水並充分捏合後，進行造粒乾燥而獲得有效成分為5質量%之粒劑。

【0159】 （製劑5：懸浮劑）

將本發明之雜環化合物10份、聚氧乙烯烷基烯丙基醚4份、聚羧酸鈉鹽2份、甘油10份、三仙膠0.2份、及水73.8份加以混合，進行濕式粉碎直至粒度成為3微米以下，獲得有效成分為10質量%之懸浮劑。

【0160】 （製劑6：顆粒水合劑）

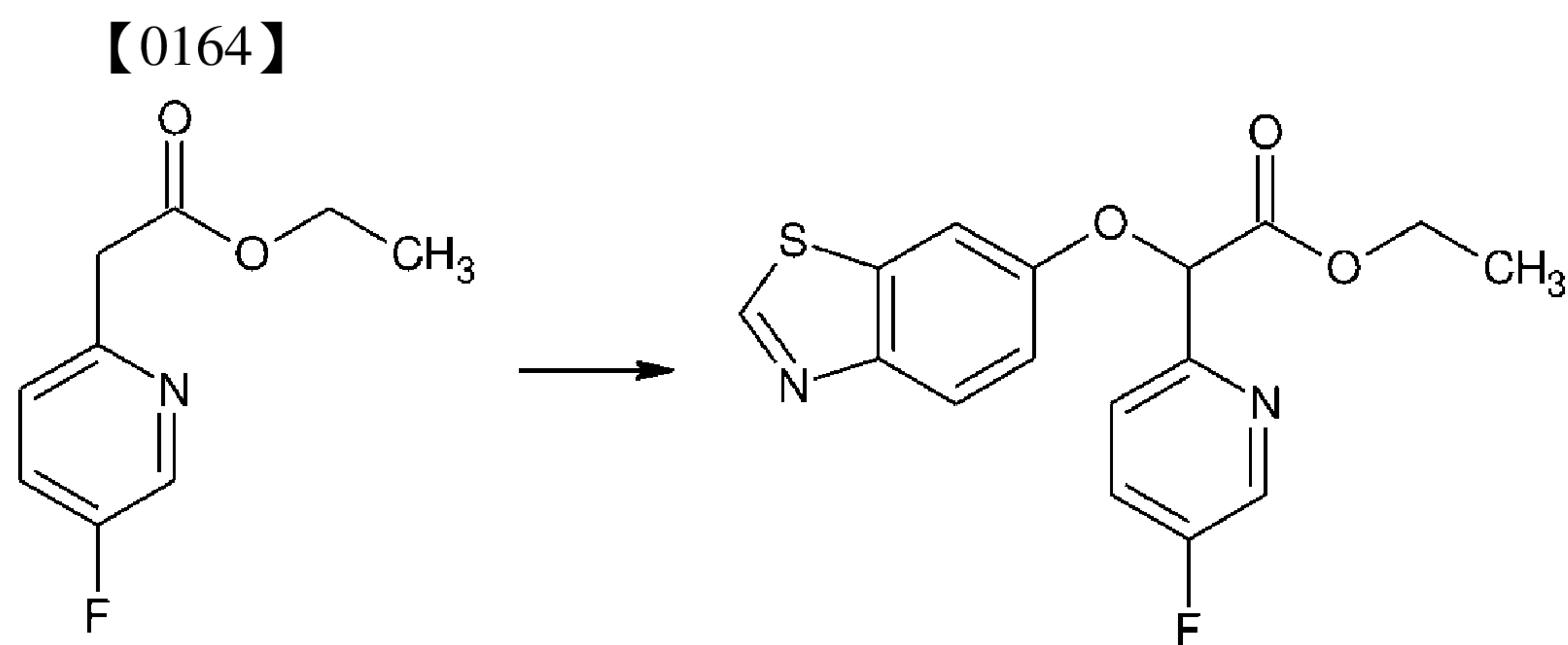
將本發明之雜環化合物40份、黏土36份、氯化鉀10份、烷基苯磺酸鈉鹽1份、木質素磺酸鈉鹽8份、及烷基苯磺酸鈉鹽之甲醛縮合物5份均勻混合而微細地粉碎後，添加適量之水進行捏合而製成黏土狀。對黏土狀物進行造粒後加以乾燥，獲得有效成分為40質量%之顆粒水合劑。

【0161】 其次，示出化合物實施例，對本發明加以更具體的說明。然而，本發明並不受以下之化合物實施例任何限制。

【0162】 [實施例1]

2-((苯并 [d] 噻唑 -6- 基 氧 基)(5- 氟 吡 啶 -2- 基) 甲 基)-1,3,4- 噁 二 唑 [2-((benzo[d]thiazol-6-yloxy)(5-fluoropyridin-2-yl)methyl)-1,3,4-oxadiazole]（化合物編號a-8）之合成

【0163】 （步驟1）2-(苯并[d]噻唑-6-基氧基)-2-(5-氟吡啶-2-基)乙酸乙酯 [ethyl 2-(benzo[d]thiazol-6-yloxy)-2-(5-fluoropyridin-2-yl)acetate]之合成



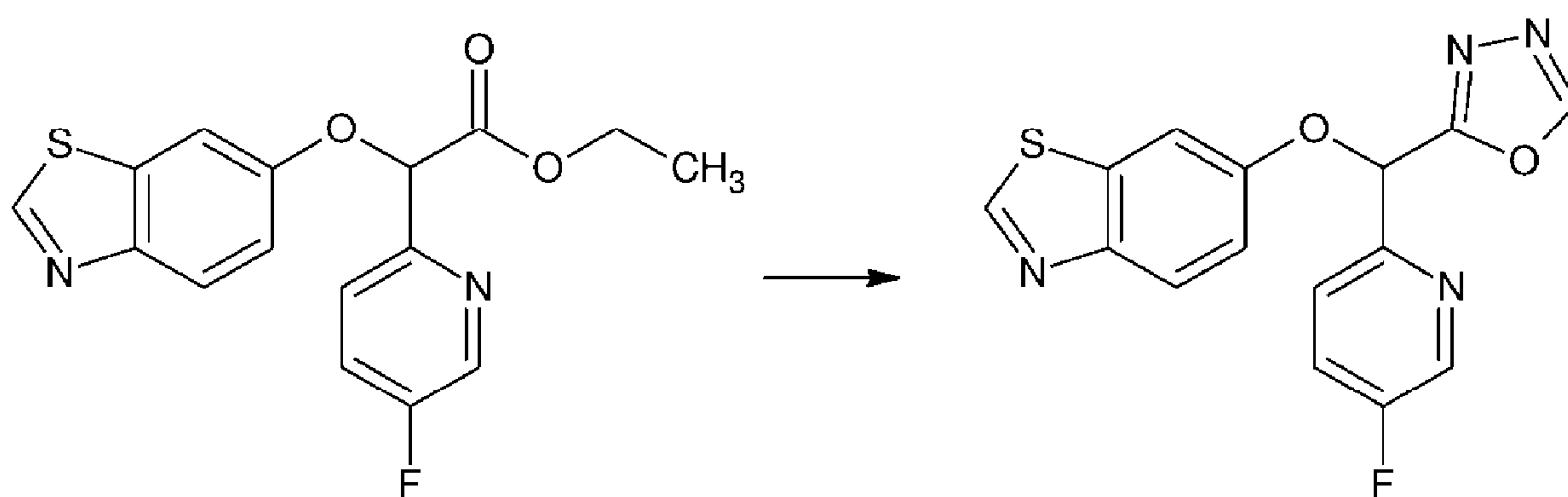
【0165】 將2-(5-氟吡啶-2-基)乙酸乙酯（1.00 g，5.46 mmol）溶解於四氯化碳（10 mL）中，添加N-溴代丁二醯亞胺（1.02 g，5.73 mmol）、過氧化苯甲醯（0.09 g，0.28 mmol），於加熱回流下進行6小時之攪拌。放置冷卻後，對反應液進行矽藻土過濾，將濾液於減壓下進行濃縮。將所獲得之殘渣之N,N-二甲基甲醯胺（1 mL）溶液添加至6-羥基苯并噻唑（0.55 g，3.62 mmol）、碳酸鉀（0.91 g，6.58 mmol）之N,N-二甲基甲醯胺（5 mL）中並於室溫下攪拌一晚。將反應液注入至水中，藉由乙酸乙酯進行萃取。藉由水、飽和食鹽水將所獲得之有機層洗淨後，藉由無水硫酸鎂進行乾燥而過濾無機物，於減壓下進行濃縮。藉由矽膠層析法對所獲得之殘渣進行純化而獲得目標物0.63 g（產率63%）。

所獲得之目標物之¹H-NMR如下所示。

¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃): δ1.23 (dd, 3H), 4.19-4.32 (m, 2H), 5.85 (s, 1H), 7.21 (d, 1H), 7.42-7.51 (m, 2H), 7.69 (dd, 1H), 8.05 (d, 1H), 8.46 (d, 1H), 8.83 (s, 1H).

【0166】 （步驟2）2-((苯并[d]噻唑-6-基氧基)(5-氟吡啶-2-基)甲基)-1,3,4-噁二唑[2-((benzo[d]thiazol-6-yloxy)(5-fluoropyridin-2-yl)methyl)-1,3,4-oxadiazole]之合成

【0167】



【0168】 將2-(苯并[d]噻唑-6-基氧基)-2-(5-氟吡啶-2-基)乙酸乙酯 (0.63 g, 1.90 mmol) 溶解於四氫呋喃 (10 mL)、乙醇 (1 mL) 中，添加胼一水合物 (0.29 g, 5.79 mmol) 而於加熱回流下進行6小時之攪拌。減壓蒸餾去除溶劑，藉由乙酸乙酯對所獲得之殘渣進行稀釋，藉由水、飽和食鹽水將有機層洗淨。藉由無水硫酸鎂對所獲得之有機層進行乾燥，過濾無機物後於減壓下進行濃縮。將所獲得之淡黃色固體 (0.49 g) 溶解於乙酸 (5 mL) 中，添加原甲酸三甲酯 (0.49 g, 4.62 mmol)，於加熱回流下進行10分鐘之攪拌。放置冷卻後，減壓蒸餾去除溶劑，藉由飽和碳酸氫鈉溶液中和所獲得之殘渣，並藉由乙酸乙酯進行萃取。藉由水、飽和食鹽水將所獲得之有機層洗淨後，藉由無水硫酸鎂進行乾燥，過濾無機物並於減壓下進行濃縮。藉由管柱層析法對所獲得之殘渣進行純化而獲得目標物0.22 g (產率35%)。

所獲得之目標物之¹H-NMR如下所示。

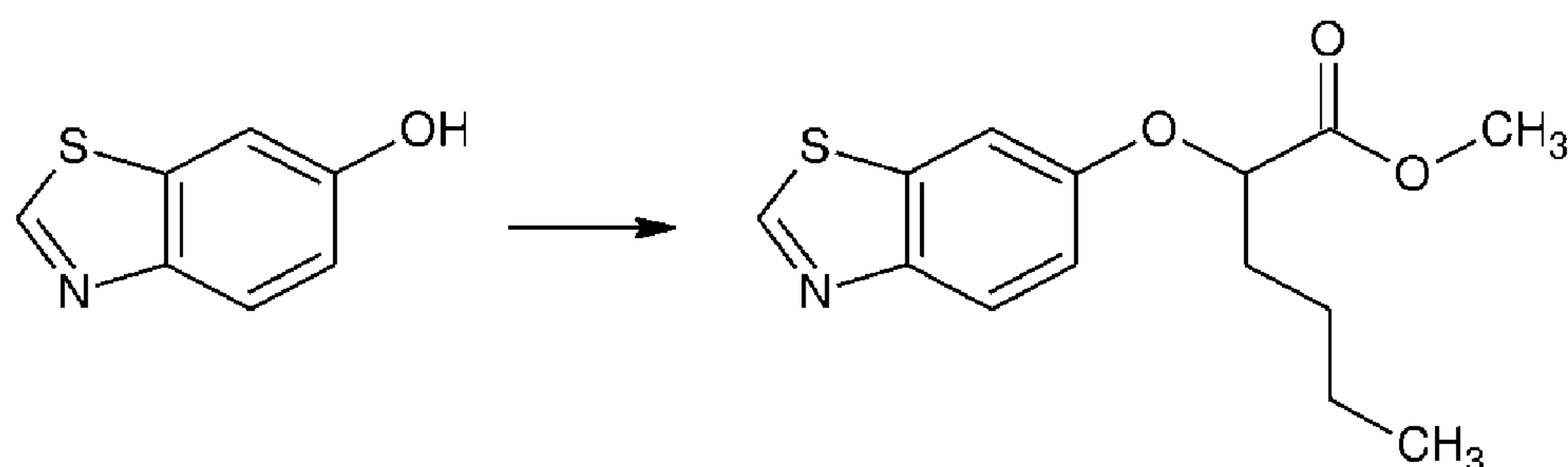
¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃): δ6.76 (s, 1H), 7.27 (dd, 1H), 7.48-7.57 (m, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.85 (dd, 1H), 8.03 (d, 1H), 8.45 (d, 2H), 8.89 (s, 1H).

【0169】 [實施例2]

2-(1-(苯并[d]噻唑-6-基氧基)戊基)-1,3,4-噁二唑 [2-(1-(benzo[d]thiazol-6-yloxy)pentyl)-1,3,4-oxadiazole] (化合物編號a-1) 之合成

【0170】 (步驟1) 2-(苯并[d]噻唑-6-基氧基)己酸乙酯 [ethyl 2-(benzo[d]thiazol-6-yloxy)hexanoate]之合成

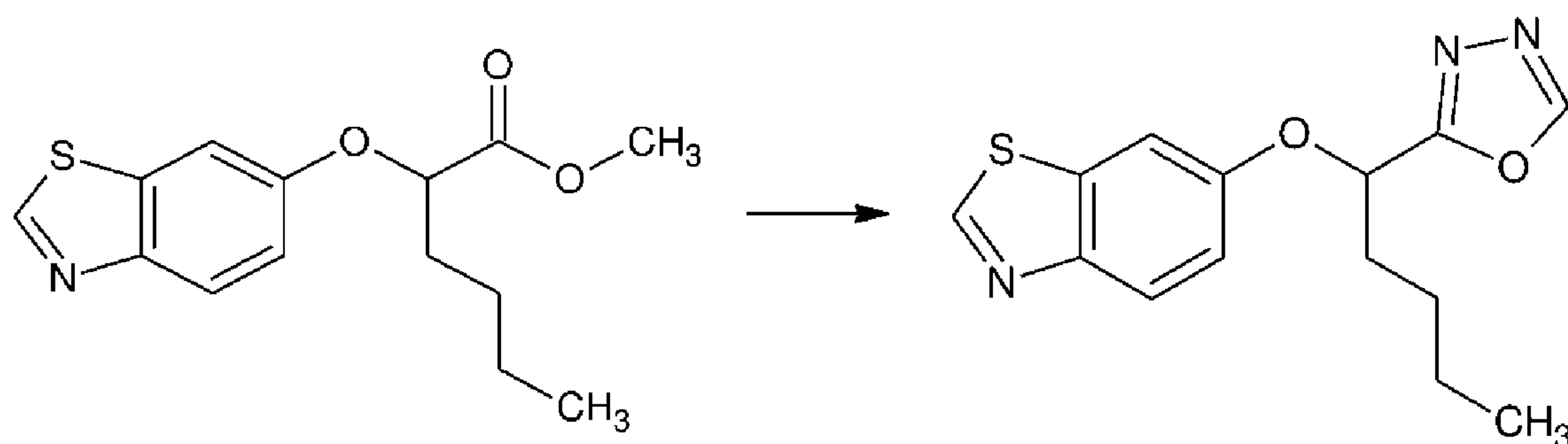
【0171】



【0172】 將6-羥基苯并噻唑（0.25 g，1.65 mmol）溶解於N,N-二甲基甲醯胺（3 mL）中，添加碳酸鉀（0.27 g，1.95 mmol）與2-溴己酸甲酯（0.38 g，1.81 mmol）並於室溫下攪拌一晚。於反應液中加入水並藉由乙酸乙酯進行萃取，藉由飽和食鹽水將所獲得之有機層洗淨。藉由無水硫酸鎂將有機層乾燥後，過濾除去無機物並於減壓下進行濃縮。藉由矽膠層析法對所獲得之殘渣進行純化而獲得目標物0.45 g（產率97%）。

【0173】 （步驟2）2-(1-(苯并[d]噻唑-6-基氧基)戊基)-1,3,4-噁二唑[2-(1-(benzo[d]thiazol-6-yloxy)pentyl)-1,3,4-oxadiazole]之合成

【0174】



【0175】 將2-(苯并[d]噻唑-6-基氧基)己酸乙酯（0.45 g，1.61 mmol）溶解於甲醇（6 mL）中，添加胼一水合物（0.40 g，7.99 mmol）並於室溫下攪拌二日。於反應溶液中添加水並藉由乙酸乙酯進行萃取，藉由飽和食鹽水將有機層洗淨。藉由無水硫酸鎂對所獲得之有機層進行乾燥，過濾無機物後於減壓下進行濃縮。將所獲得之淡黃色固體（0.42 g）溶解於乙酸（4 mL）中，添加原甲酸三甲酯（0.80 g，7.54 mmol）而於加熱回流下進行15分鐘之攪拌。放置冷卻後，減壓蒸餾去除

溶劑並藉由飽和碳酸氫鈉溶液對所獲得之殘渣進行中和，藉由乙酸乙酯進行萃取。藉由飽和食鹽水將所獲得之有機層洗淨後，藉由無水硫酸鎂進行乾燥，過濾無機物並減壓下進行濃縮。藉由管柱層析法對所獲得之殘渣進行純化而獲得目標物0.29 g（產率67%）。

所獲得之目標物之¹H-NMR如下所示。

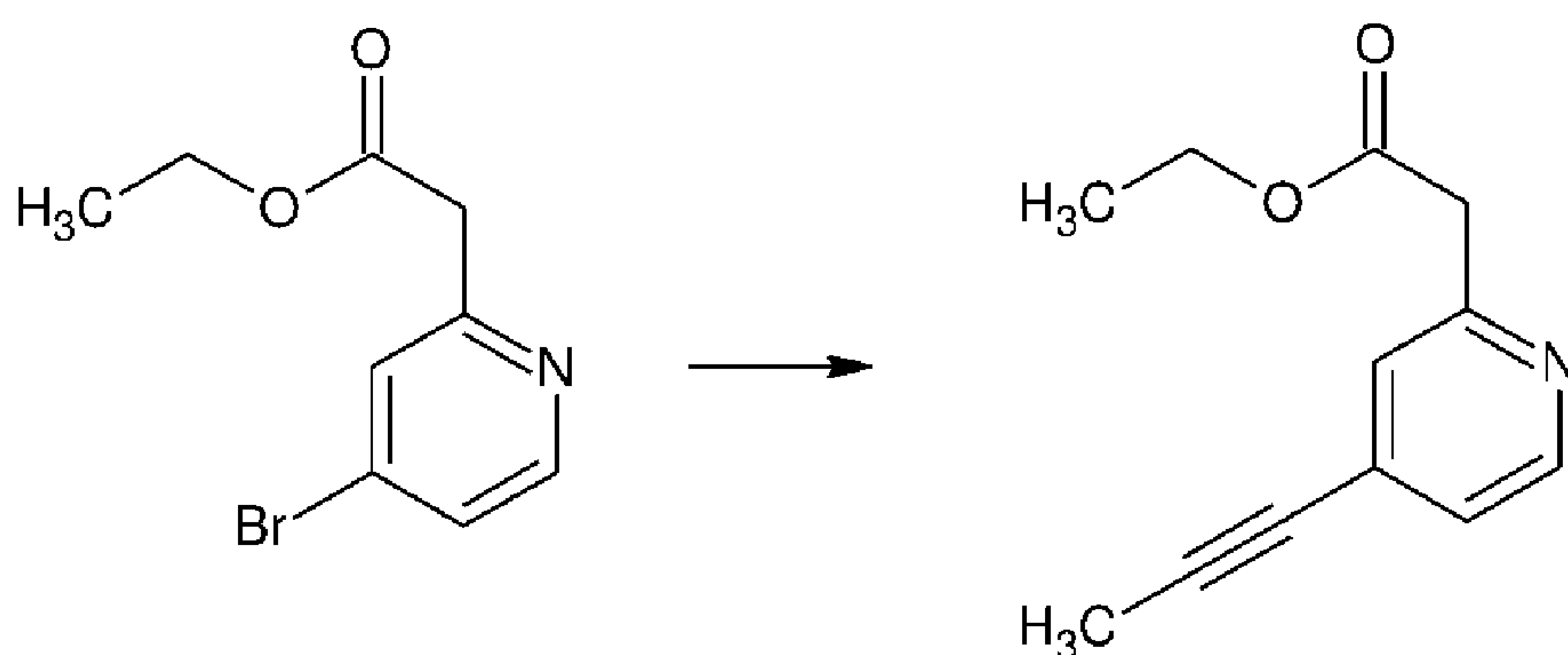
¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃): δ0.92 (dd, 3H), 1.31-1.46 (m, 3H), 1.50-1.61 (m, 1H), 2.01-2.13 (m, 1H), 2.20-2.31 (m, 1H), 5.55 (dd, 1H), 7.18 (dd, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.99 (d, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.84 (s, 1H).

【0176】 [實施例3]

2-((苯并[d]噻唑-6-基氧基)(4-(1-丙炔基)吡啶-2-基)甲基)-1,3,4-噁二唑[2-((benzo[d]thiazol-6-yloxy)(4-(prop-1-yn-1-yl)pyridin-2-yl)methyl)-1,3,4-oxadiazole]（化合物編號a-45）之合成

【0177】 （步驟1）4-((1-丙炔基)吡啶-2-基)乙酸乙酯[ethyl 2-(4-(prop-1-yn-1-yl)pyridin-2-yl)acetate]之合成

【0178】



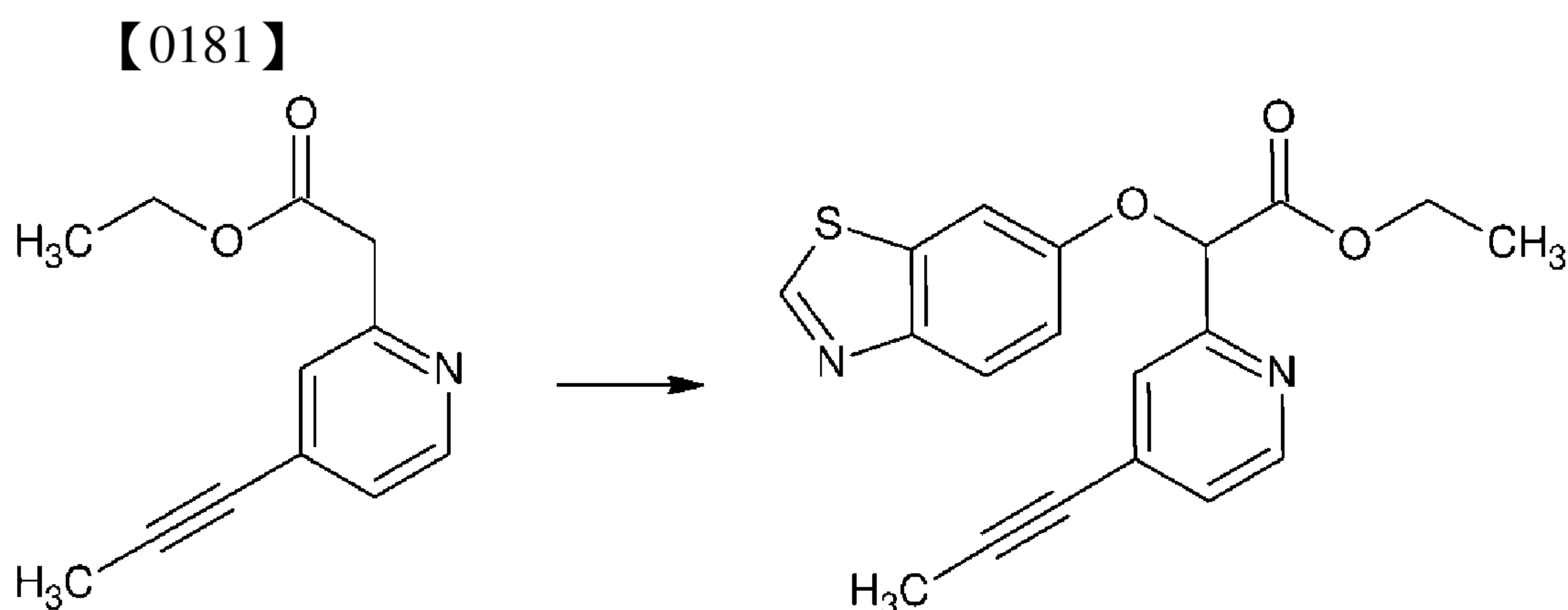
【0179】 將2-(4-溴吡啶-2-基)乙酸乙酯（0.65 g，2.66 mmol）溶解於三乙胺（10 mL）中，添加1-(三甲基矽基)-1-丙炔（0.33 g，2.93 mmol）、碘化銅(I)（51 mg，0.26 mmol）、雙(三苯基膦)二氯化鈣(II)（0.19 g，0.27 mmol）、四正丁基氟化銨（1M四氫呋喃溶液）（3 mL），藉由氮氣對反應容器內進行置換，於70℃下

攪拌一晚。放置冷卻後，藉由乙酸乙酯對反應液進行稀釋，添加飽和氯化銨水溶液進行萃取後，藉由水將其洗淨。藉由無水硫酸鎂對所獲得之有機層進行乾燥，過濾無機物並於減壓下進行濃縮。藉由管柱層析法對所獲得之殘渣進行純化而獲得目標物0.38 g（產率70%）。

所獲得之目標物之 $^1\text{H-NMR}$ 如下所示。

$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3): δ 1.26 (t, 3H), 2.07 (s, 3H), 3.79 (s, 2H), 4.18 (q, 2H), 7.14 (dd, 1H), 7.26 (s, 1H), 8.46 (d, 1H).

【0180】（步驟2）2-(苯并[d]噻唑-6-基氧基)-2-(4-(1-丙炔基)吡啶-2-基)乙酸乙酯[ethyl 2-(benzo[d]thiazol-6-yloxy)-2-(4-(prop-1-yn-1-yl)pyridin-2-yl)acetate]之合成

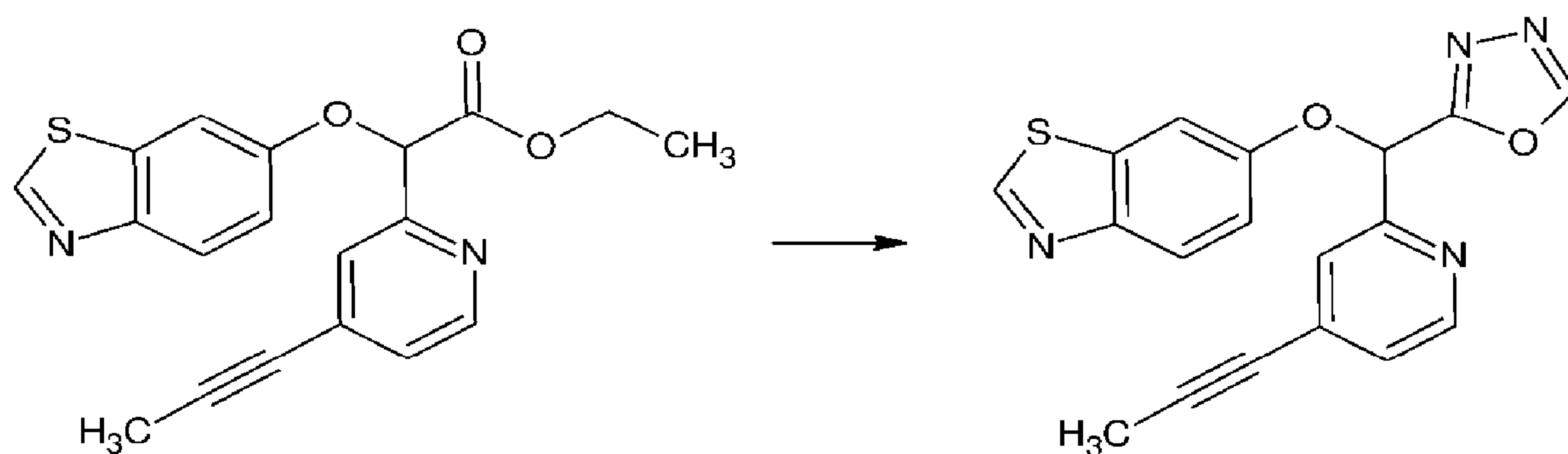


【0182】將4-((1-丙炔基)吡啶-2-基)乙酸乙酯（0.38 g，1.87 mmol）溶解於四氯化碳（6 mL）中，添加N-溴代丁二醯亞胺（0.33 g，1.87 mmol）、過氧化苯甲醯（60 mg，0.18 mmol），於加熱回流下進行2小時之攪拌。放置冷卻後，對反應液進行矽藻土過濾，將濾液於減壓下進行濃縮。將所獲得之殘渣之丙酮溶液添加至6-羥基苯并噻唑（0.14 g，0.93 mmol）、碳酸鉀（0.39 g，2.82 mmol）之丙酮（4 mL）中並於室溫下攪拌一晚。將反應液注入至水中，藉由乙酸乙酯進行萃取。藉由水、飽和食鹽水將所獲得之有機層洗淨後，藉由無水硫酸鎂進行乾燥並過濾無機物，於減壓下進行濃縮。藉由胺基矽膠層析法對所獲得之殘渣進行純化

而獲得目標物0.17 g (產率51%)。

【0183】 (步驟3) 2-((苯并[d]噻唑-6-基氧基)(4-(1-丙炔基)吡啶-2-基)甲基)-1,3,4-噁二唑[2-((benzo[d]thiazol-6-yloxy)(4-(prop-1-yn-1-yl)pyridin-2-yl)methyl)-1,3,4-oxadiazole]之合成

【0184】



【0185】 將2-(苯并[d]噻唑-6-基氧基)-2-(4-(1-丙炔基)吡啶-2-基)乙酸乙酯(0.17 g, 0.48 mmol)溶解於四氫呋喃(3 mL)中,添加胼一水合物(96 mg, 1.91 mmol)、1滴1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯並於室溫下攪拌一晚。於反應溶液中添加水,藉由乙酸乙酯進行萃取,藉由飽和食鹽水將有機層洗淨。藉由無水硫酸鎂對所獲得之有機層進行乾燥,過濾無機物後於減壓下進行濃縮。將所獲得之殘渣溶解於乙酸(4 mL)中,添加原甲酸三甲酯(0.20 g, 1.88 mmol)並於加熱回流下進行30分鐘之攪拌。將所獲得之反應液於減壓下進行濃縮,添加乙酸乙酯並藉由飽和碳酸氫鈉溶液進行洗淨後,藉由管柱層析法進行純化而獲得目標物0.07 g (產率41%)。

所獲得之目標物之¹H-NMR如下所示。

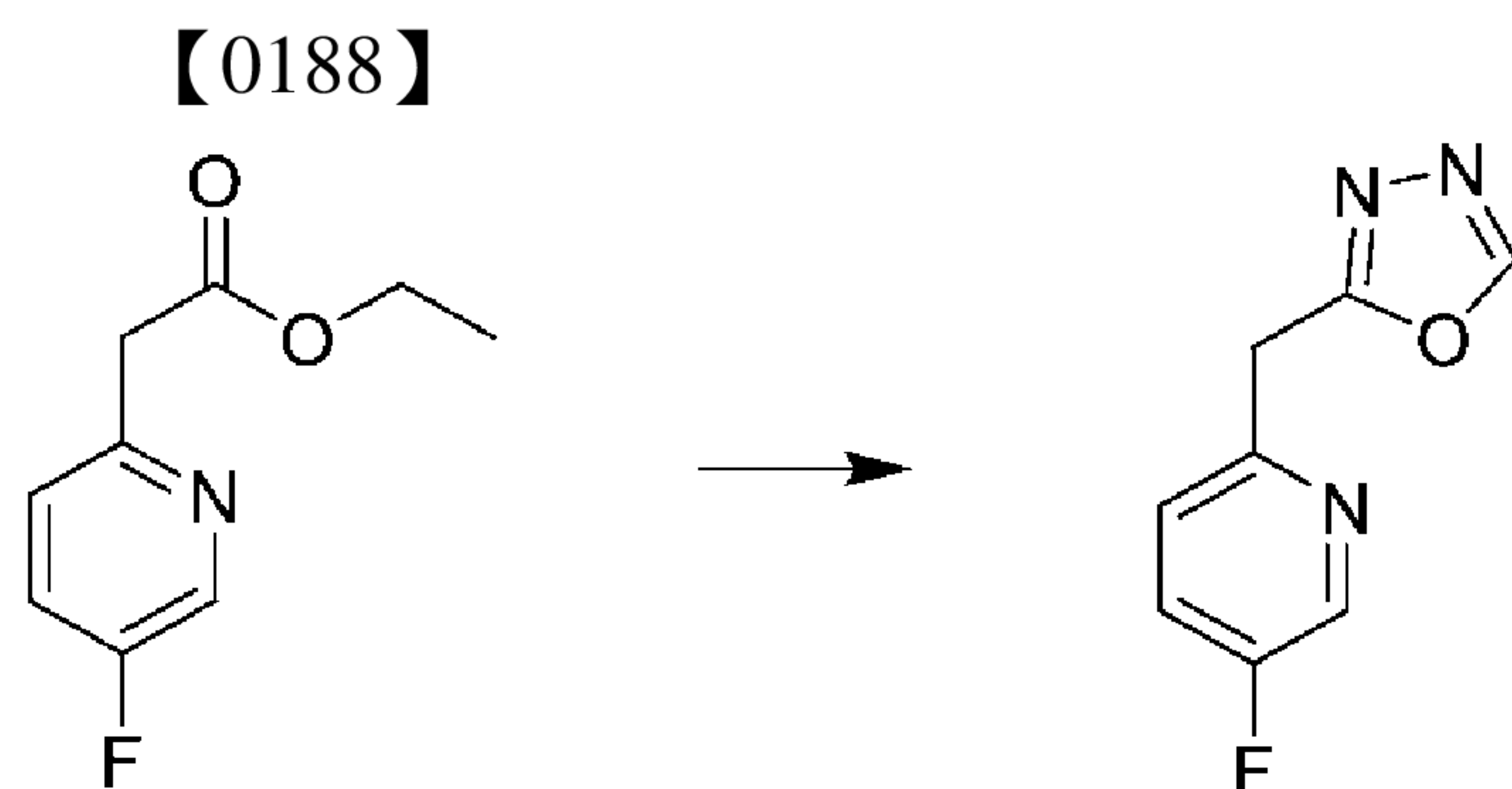
¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃): δ2.08 (s, 3H), 6.72 (s, 1H), 7.23-7.32 (m, 2H), 7.60 (d, 1H), 7.77 (s, 1H), 8.03 (d, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.51 (d, 1H), 8.87 (s, 1H).

【0186】 [實施例4]

2-((4-溴苯并[d]噻唑-6-基氧基)(5-氟吡啶-2-基)甲基)-1,3,4-噁二唑[2-((4-

bromobenzo[d]thiazol-6-yloxy)(5-fluoropyridin-2-yl)methyl)-1,3,4-oxadiazole](化合物編號a-20)之合成

【0187】 (步驟1) 2-((5-氟吡啶-2-基)甲基)-1,3,4-噁二唑 [2-((5-fluoropyridin-2-yl)methyl)-1,3,4-oxadiazole]之合成

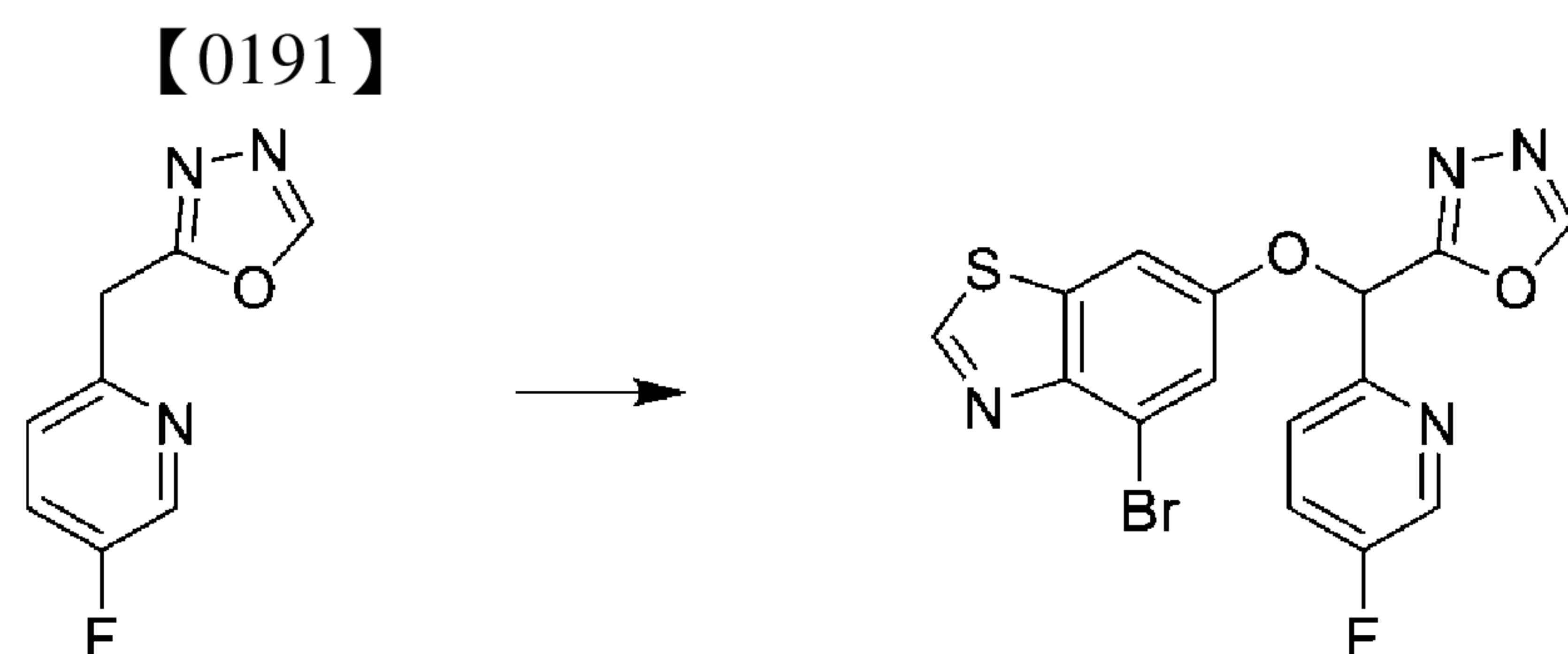


【0189】 將2-(5-氟吡啶-2-基)乙酸乙酯 (30.0 g, 164 mmol) 溶解於四氫呋喃 (540 mL) 中，添加胼一水合物 (24.6 g, 5491 mmol)、1,8-二氮雜雙環[5.4.0]-7-十一烯 (5.0 g, 32.8 mmol) 並加熱回流下攪拌一晚。減壓蒸餾去除溶劑並藉由醚將所獲得之殘渣洗淨，濾取淡黃色固體。將所獲得之淡黃色固體 (34.1g) 溶解於乙酸 (540 mL) 中，添加原甲酸三甲酯 (86.9 g, 819 mmol) 並於加熱回流下進行30分鐘之攪拌。放置冷卻後，減壓蒸餾去除溶劑並藉由飽和碳酸氫鈉溶液中和所獲得之殘渣，藉由乙酸乙酯進行萃取。藉由水、飽和食鹽水將所獲得之有機層洗淨後，藉由無水硫酸鎂進行乾燥，過濾無機物並於減壓下進行濃縮。藉由管柱層析法對所獲得之殘渣進行純化而獲得目標物23.9 g (產率81%)。

所獲得之目標物之¹H-NMR如下所示。

¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃): δ4.42 (s, 2H), 7.25-7.39 (m, 2H), 8.36-8.39 (m, 2H).

【0190】 (步驟2) 2-((4-溴苯并[d]噻唑-6-基氧基)(5-氟吡啶-2-基)甲基)-1,3,4-噁二唑 [2-((4-bromobenzo[d]thiazol-6-yloxy)(5-fluoropyridin-2-yl)methyl)-1,3,4-oxadiazole] 之合成



【0192】 將2-((5-氟吡啶-2-基)甲基)-1,3,4-噁二唑（1.50 g，8.37 mmol）溶解於四氯化碳（20 mL）中，添加N-溴代丁二醯亞胺（1.49 g，8.37 mmol）、過氧化苯甲醯（0.10 g，0.41 mmol）並加熱回流下進行2小時之攪拌。放置冷卻後，對反應液進行矽藻土過濾，將濾液於減壓下進行濃縮。將所獲得之殘渣之丙酮（30 mL）溶液添加於4-溴-6-羥基苯并噻唑（1.50 g，6.52 mmol）、碳酸鉀（1.80 g，13.02 mmol）中，於室溫下攪拌一晚。對反應液進行矽藻土過濾，將濾液於減壓下進行濃縮。藉由矽膠層析法對所獲得之殘渣進行純化而獲得目標物0.64 g（產率24%）。

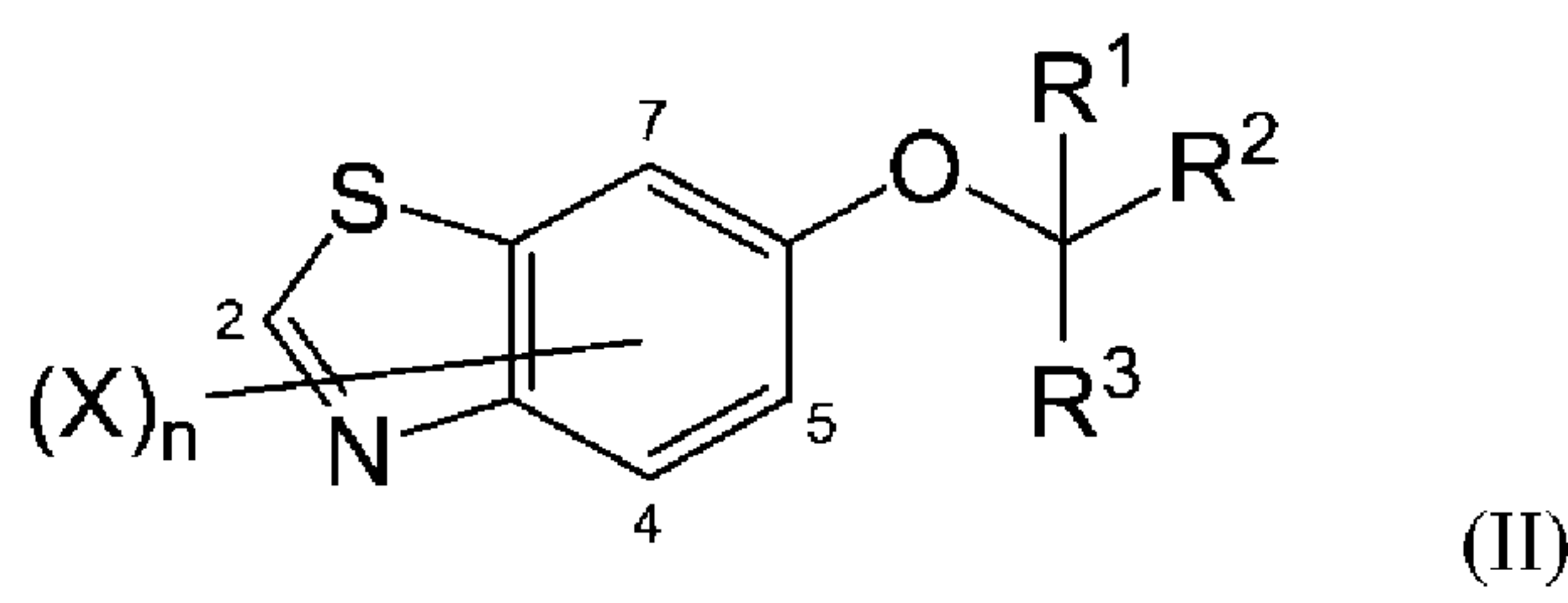
所獲得之目標物之¹H-NMR如下所示。

¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃): δ6.72 (s, 1H), 7.52-7.60 (m, 3H), 7.82 (dd, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.94 (s, 1H).

【0193】 將藉由與上述實施例同樣之方法而製造之本發明化合物之一部分示於表1～表2中。表1示出式(II)所表示之化合物中之取代基。於表中一併示出作為各化合物之物性的性狀、熔點（m.p.）或折射率（n_D）。於表2中，示出N（氮原子）與O（氧原子）之間之鍵（N-O undefined stereo bond）的波狀線表示氮碳雙鍵之E體或Z體或該等之混合物。

再者，表中之Me表示甲基，Et表示乙基，ⁿPr表示正丙基，ⁱPr表示異丙基，ⁿBu表示正丁基，^tBu表示第三丁基，ⁿHex表示正己基，^cPr表示環丙基，Boc表示第三丁氧基羰基。

【0194】



【0195】

表1

化合物編號	R ¹	R ²	R ³	(X) _n	物性
a-1	H	1,3,4-噁二唑-2-基	ⁿ Bu	-	黏性油
a-2	H	1,3,4-噁二唑-2-基	苯基	2-Me	非晶形
a-3	H	1,3,4-噁二唑-2-基	ⁿ Bu	2-Me	黏性油
a-4	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-F-苯基	-	非晶形
a-5	H	1,3,4-噁二唑-2-基	吡啶-2-基	-	非晶形
a-6	H	1,3,4-噁二唑-2-基	苯基	2-Cl	m.p.： 108-110℃
a-7	H	1,3,4-噁二唑-2-基	ⁿ Bu	2-Cl	黏性油
a-8	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	-	m.p.： 106-108℃
a-9	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Cl-吡啶-2-基	-	m.p.： 129-130℃
a-10	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Me-吡啶-2-基	-	m.p.： 122-125℃
a-11	H	5-F-吡啶-2-基	COOEt	-	m.p.： 105-106℃
a-12	H	1,3,4-噁二唑-2-基	SMe	-	m.p.： 100-102℃
a-13	H	1,3,4-噁二唑-2-基	Et	-	n _D （20.6 ℃） 1.5735
a-14	H	1,3,4-噁二唑-2-基	苯基	-	黏性油
a-15	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Cl-嘧啶-2-基	-	非晶形
a-16	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-嘧啶-2-基	-	m.p.： 155-161℃
a-17	H	噁唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	-	m.p.： 100-102℃
a-18	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	2-SMe	m.p.： 122-124℃
a-19	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4-Me	黏性油

【0196】

表1（續）

化合物編號	R ¹	R ²	R ³	(X) _n	物性
a-20	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4-Br	m.p.：179-182℃
a-21	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4-苯基	非晶形
a-22	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4- ⁿ Pr	m.p.：118-119℃
a-23	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4-(4-CF ₃ -苯基)	m.p.：172-176℃
a-24	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4-(4-OMe-苯基)	黏性油
a-25	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4-(3-OCF ₃ -苯基)	黏性油
a-26	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4- ⁿ Hex	m.p.：87-89℃
a-27	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Cl-吡啶-2-基	4-苯基	n _D （20.4℃）1.6142
a-28	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Cl-吡啶-2-基	4- ⁿ Pr	n _D （20.4℃）1.5945
a-29	H	5-Cl-嘧啶-2-基	COOEt	4-苯基	m.p.：96-100℃
a-30	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Cl-嘧啶-2-基	4-苯基	m.p.：155-157℃
a-31	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-嘧啶-2-基	4-苯基	非晶形
a-32	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	2-Me	m.p.：110-113℃
a-33	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Cl-吡啶-2-基	2-Me	m.p.：119-121℃
a-34	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-Cl-苯基	-	m.p.：108-109℃
a-35	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Br-吡啶-2-基	-	n _D （20.3℃）1.614
a-36	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	2-NH ₂	m.p.：188-192℃
a-37	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-CN-吡啶-2-基	-	m.p.：174-180℃
a-38	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-SMe-吡啶-2-基	-	非晶形

【0197】

表1（續）

化合物編號	R ¹	R ²	R ³	(X) _n	物性
a-39	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-SOMe-吡啶-2-基	-	黏性油
a-40	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	2-Cl	m.p.：140-143℃
a-41	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	2-F	m.p.：165-168℃
a-42	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-(1H-吡唑-3-基)吡啶-2-基	-	非晶形
a-43	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4-I	m.p.：196-201℃
a-44	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	5-F	m.p.：128-131℃
a-45	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(丙-1-炔-1-基)吡啶-2-基	-	m.p.：121-123℃
a-46	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4-F	m.p.：127-129℃
a-47	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Cl-吡啶-2-基	4-F	m.p.：155-158℃
a-48	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4-Cl	m.p.：175-177℃
a-49	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	5-Cl	m.p.：158-159℃
a-50	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Cl-吡啶-2-基	5-F	m.p.：125-127℃
a-51	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Cl-吡啶-2-基	5-Cl	m.p.：152-155℃
a-52	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Br-吡咩-2-基	4-Cl	m.p.：185-187℃
a-53	H	1,3,4-噁二唑-2-基	2-Cl-噻唑-4-基	-	黏性油
a-54	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(丙-1-炔-1-基)吡啶-2-基	4-F	m.p.：162-164℃
a-55	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(丙-1-炔-1-基)吡啶-2-基	4-Cl	m.p.：149-152℃
a-56	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(丙-1-炔-1-基)吡啶-2-基	5-F	m.p.：151-153℃
a-57	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Br-吡咩-2-基	-	非晶形

【0198】

表1（續）

化合物 編號	R ¹	R ²	R ³	(X) _n	物性
a-58	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Me-吡咩-2-基	-	黏性油
a-59	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(丙-1-炔-1-基)吡啶-2-基	5-Cl	m.p.： 190-191℃
a-60	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Cl-4-(丙-1-炔-1-基)吡啶-2-基	-	m.p.： 183-185℃
a-61	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4-乙烯基	m.p.： 115-117℃
a-62	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Cl-4-(3-OMe-丙-1-炔-1-基)吡啶-2-基	-	黏性油
a-63	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-Cl-4-乙炔基吡啶-2-基	-	m.p.： 167-170℃
a-64	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(3-OMe-丙-1-炔-1-基)吡啶-2-基	-	m.p.： 122-124℃
a-65	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4-CF ₃	m.p.： 173-174℃
a-66	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	2-CN	m.p.： 153-154℃
a-67	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	2-COOMe	m.p.： 205-207℃
a-68	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4-Et	m.p.： 133-135℃
a-69	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-Br-吡啶-2-基	-	非晶形
a-70	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4-CH ₂ F	m.p.： 147-149℃
a-71	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4- ⁿ Pr-吡啶-2-基	-	黏性油
a-72	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-吡啶-2-基	4-CHF ₂	m.p.： 184-185℃
a-73	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-OMe-吡啶-2-基	-	黏性油
a-74	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-CH ₂ OMe-吡啶-2-基	-	n _D （22.2℃） 1.5925
a-75	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-CH ₂ OEt-吡啶-2-基	-	n _D （19.5℃） 1.5881
a-76	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-CH ₂ SMe-吡啶-2-基	-	黏性油

【0199】

表1（續）

化合物編號	R ¹	R ²	R ³	(X) _n	物性
a-77	H	1,3,4-噁二唑-2-基	6-(丙-1-炔-1-基)嘧啶-4-基	-	m.p.：133-135℃
a-78	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-乙炔基吡啶-2-基	-	m.p.：121-123℃
a-79	H	1,3,4-噁二唑-2-基	6- ⁿ Pr-嘧啶-4-基	-	黏性油
a-80	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-苯基-吡啶-2-基	-	非晶形
a-81	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(丙-1-炔-1-基)吡啶-2-基	-	m.p.：163-166℃
a-82	H	4-Br-吡啶-2-基	COOMe	-	m.p.：101-102℃
a-83	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(吡啶-2-基)吡啶-2-基	-	非晶形
a-84	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-苯基-吡啶-2-基	4-Br	黏性油
a-85	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(噻吩-2-基)吡啶-2-基	-	黏性油
a-86	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(吡啶-4-基)吡啶-2-基	-	非晶形
a-87	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-苯基-吡啶-2-基	4- ⁿ Pr	m.p.：127-129℃
a-88	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-苯基-吡啶-2-基	4-Et	黏性油
a-89	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(CH(OMe) ₂)-5-F-吡啶-2-基	-	m.p.：127-129℃
a-90	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(CH(OMe) ₂)吡啶-2-基	-	非晶形
a-91	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-苯基-吡啶-2-基	2-Me	非晶形
a-92	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-苯基-吡啶-2-基	2-OMe	非晶形
a-93	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	-	m.p.：67-69℃
a-94	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-苯基-5-F-吡啶-2-基	-	n _D （20.8℃）1.6138
a-95	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-苯基-5-F-吡啶-2-基	2-Me	n _D （20.7℃）1.6049

【0200】

表1（續）

化合物編號	R ¹	R ²	R ³	(X) _n	物性
a-96	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-苯基-5-F-吡啶-2-基	4-F	m.p.：129-132℃
a-97	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(吡啶-3-基)吡啶-2-基	-	n _D （21.6℃）1.6201
a-98	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(4-F-苯基)吡啶-2-基	-	m.p.：148-150℃
a-99	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(3-F-苯基)吡啶-2-基	-	非晶形
a-100	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(2-F-苯基)吡啶-2-基	-	m.p.：117-118℃
a-101	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(4-OMe-苯基)吡啶-2-基	-	n _D （22.1℃）1.6266
a-102	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-O ⁿ Pr-吡啶-2-基	-	n _D （20.7℃）1.5937
a-103	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-苯基嘧啶-2-基	-	黏性油
a-104	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-CH ₂ OTBS-5-F-吡啶-2-基	-	n _D （21.3℃）1.5507
a-105	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-CH ₂ OH-5-F-吡啶-2-基	-	非晶形
a-106	Me	1,3,4-噁二唑-2-基	4-CH ₂ OH-5-F-吡啶-2-基	-	非晶形
a-107	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(1,3-二氧戊環-2-基)吡啶-2-基	-	n _D （21.4℃）1.5924
a-108	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(1,3-二噁烷-2-基)吡啶-2-基	-	n _D （20.7℃）1.5720
a-109	H	1,3,4-噁二唑-2-基	3-Me-4-苯基吡啶-2-基	-	m.p.：180-183℃
a-110	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-CH ₂ OMe-5-F-吡啶-2-基	-	m.p.：91-95℃
a-111	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-CH ₂ OMe-5-F-吡啶-2-基	2-Me	m.p.：142-146℃
a-112	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-CH ₂ OMe-5-F-吡啶-2-基	2-Me-4-Et	m.p.：96-101℃
a-113	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-Cl-5-F-吡啶-2-基	-	m.p.：112-116℃
a-114	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-氟-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me	m.p.：95-97℃

【0201】

表1（續）

化合物 編號	R ¹	R ²	R ³	(X) _n	物性
a-115	H	1,3,4-呋二唑-2-基	5-F-4-(嘧啶-5-基)吡啶-2-基	-	黏性油
a-116	H	1,3,4-呋二唑-2-基	5-F-4-(1-Me-1H-吡唑-4-基)吡啶-2-基	-	黏性油
a-117	H	1,3,4-呋二唑-2-基	5-F-4-(1H-吡唑-4-基)吡啶-2-基	-	非晶形
a-118	H	1,3,4-呋二唑-2-基	4-COOMe-吡啶-2-基	-	m.p.：114-117℃
a-119	H	1,3,4-呋二唑-2-基	4-C(=O)NHMe-吡啶-2-基	-	非晶形
a-120	H	1,3,4-呋二唑-2-基	5-F-4-((1-異丙氧基乙氧基)甲基)吡啶-2-基	-	黏性油
a-121	H	1,3,4-呋二唑-2-基	5-F-4-(((2-甲氧基丙烷-2-基)氧基)甲基)吡啶-2-基	-	黏性油
a-122	H	1,3,4-呋二唑-2-基	4-((1-乙氧基乙氧基)甲基)-5-F-吡啶-2-基	-	n _D （20.7℃）1.5531
a-123	H	1,3,4-呋二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-(丙-1-烯-2-基)	黏性油
a-124	H	1,3,4-呋二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2- ⁱ Pr	黏性油
a-125	H	1,3,4-呋二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me-4-Et	黏性油
a-126	H	1,3,4-呋二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-N(Boc)Me	黏性油
a-127	H	1,3,4-呋二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-NHMe	黏性油
a-128	H	1,3,4-呋二唑-2-基	4-(1,3-二氧戊環-2-基)-5-F-吡啶-2-基	2-Me	m.p.：102-103℃
a-129	H	1,3,4-呋二唑-2-基	4-(1,3-二氧戊環-2-基)-5-F-吡啶-2-基	2-Me-4-Et	m.p.：99-100℃
a-130	H	1,3,4-呋二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2- ^c Pr	黏性油
a-131	H	1,3,4-呋二唑-2-基	5-F-4-I-吡啶-2-基	2-Me	m.p.：168-170℃
a-132	H	1,3,4-呋二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-乙烯基	黏性油

【0202】

表1（續）

化合物編號	R ¹	R ²	R ³	(X) _n	物性
a-133	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Et	黏性油
a-134	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(1-Me-1H-吡唑-4-基)吡啶-2-基	2-Me	非晶形
a-135	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(1-Me-1H-吡唑-5-基)吡啶-2-基	2-Me	m.p. : 188-189℃
a-136	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(6-OH-吡啶-3-基)-吡啶-2-基	2-Me	m.p. : 216-217℃
a-137	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(1,3-二硫雜環戊烷-2-基)-5-F-吡啶-2-基	-	n _D (21.2℃) 1.6130
a-138	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(1,3-二硫雜環戊烷-2-基)-5-F-吡啶-2-基	2-Me	n _D (21.9℃) 1.6056
a-139	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(1,3-二硫雜環戊烷-2-基)-5-F-吡啶-2-基	2-Me-4-Et	n _D (21.2℃) 1.5991
a-140	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(1,3-二氧戊環-2-基)-5-F-吡啶-2-基	2-N(Boc)Me	n _D (24.3℃) 1.5587
a-141	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(1,3-二氧戊環-2-基)-5-F-吡啶-2-基	2-NHMe	非晶形
a-142	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(2-(1,3-二氧戊環-2-基)乙基)-5-F-吡啶-2-基	2-Me	m.p. : 110-113℃
a-143	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(((甲硫基)甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me	黏性油
a-144	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(((2-甲氧基乙氧基)甲氧基)甲基)吡啶-2-基	-	黏性油
a-145	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(((2-甲氧基乙氧基)甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me	黏性油
a-146	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(((2-甲氧基乙氧基)甲氧基)甲基)吡啶-2-基	4-OMe	黏性油
a-147	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	4-OMe	黏性油
a-148	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	4-NHMe	黏性油
a-149	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	4-NH ₂	黏性油

【0203】

表1（續）

化合物編號	R ¹	R ²	R ³	(X) _n	物性
a-150	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-((1-乙氧基乙氧基)甲基)-5-F-吡啶-2-基	2-Me	n _D （23.5℃） 1.5600
a-151	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-((1-異丙氧基乙氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me	n _D （23.7℃） 1.5467
a-152	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(((2-甲氧基丙烷-2-基)氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me	n _D （24.1℃） 1.5531
a-153	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(羥基甲基)吡啶-2-基	2-Me	m.p.：177-178℃
a-154	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-COOMe	m.p.：110-113℃
a-155	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-CH ₂ OH	黏性油
a-156	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(羥基甲基)吡啶-2-基	2-CH ₂ OH	m.p.：199-202℃
a-157	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(乙醯氧基甲基)-5-F-吡啶-2-基	2-Me	n _D （24.8℃） 1.5790
a-158	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-((2-甲氧基乙氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me	n _D （20.0℃） 1.5606
a-159	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me	黏性油
a-160	H	噁唑-5-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me	黏性油
a-161	H	噁唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me	黏性油
a-162	H	1,3,4-噁唑-2-基	5-F-4- ⁿ Pen-吡啶-2-基	2-Me	n _D （20.7℃） 1.5744
a-163	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(2-甲氧基乙氧基)吡啶-2-基	2-Me	m.p.：107-109℃

【0204】

表1（續）

化合物編號	R ¹	R ²	R ³	(X) _n	物性
a-164	H	5-Me-1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(2-甲氧基乙氧基)吡啶-2-基	2-Me	黏性油
a-165	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(1,3-二氧戊環-2-基)-5-F-吡啶-2-基	-	n _D （20.8℃） 1.5771
a-166	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(1,3-二氧戊環-2-基)-5-F-吡啶-2-基	4-OMe	m.p.：162-163℃
a-167	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-((2-甲氧基乙醯氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me	m.p.：44-48℃
a-168	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(((甲氧基羰基)氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me	黏性油
a-169	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-((甲氧基甲氧基)甲基)嘧啶-2-基	2-Me	黏性油
a-170	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(((二甲基胺甲醯基)氧基)甲基)-5-F-吡啶-2-基	2-Me	黏性油
a-171	H	1,2,4-噁二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me	黏性油
a-172	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-苄基-5-F-吡啶-2-基	2-Me	n _D （20.1℃） 1.5955
a-173	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN-5-F-吡啶-2-基	2-Me	n _D （20.0℃） 1.5741
a-174	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(((3-甲氧基丙醯基)氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me	黏性油
a-175	H	1,3,4-噁唑-2-基	4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me	黏性油
a-176	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-CN-吡啶-2-基	2-Me	非晶形
a-177	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-CH ₂ CH ₂ OMe	n _D （19.8℃） 1.5569
a-178	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(呋喃-2-基)吡啶-2-基	2-Me	m.p.：146-147℃
a-179	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(3,6-二氫-2H-吡喃-4-基)-5-F-吡啶-2-基	2-Me	m.p.：133-134℃

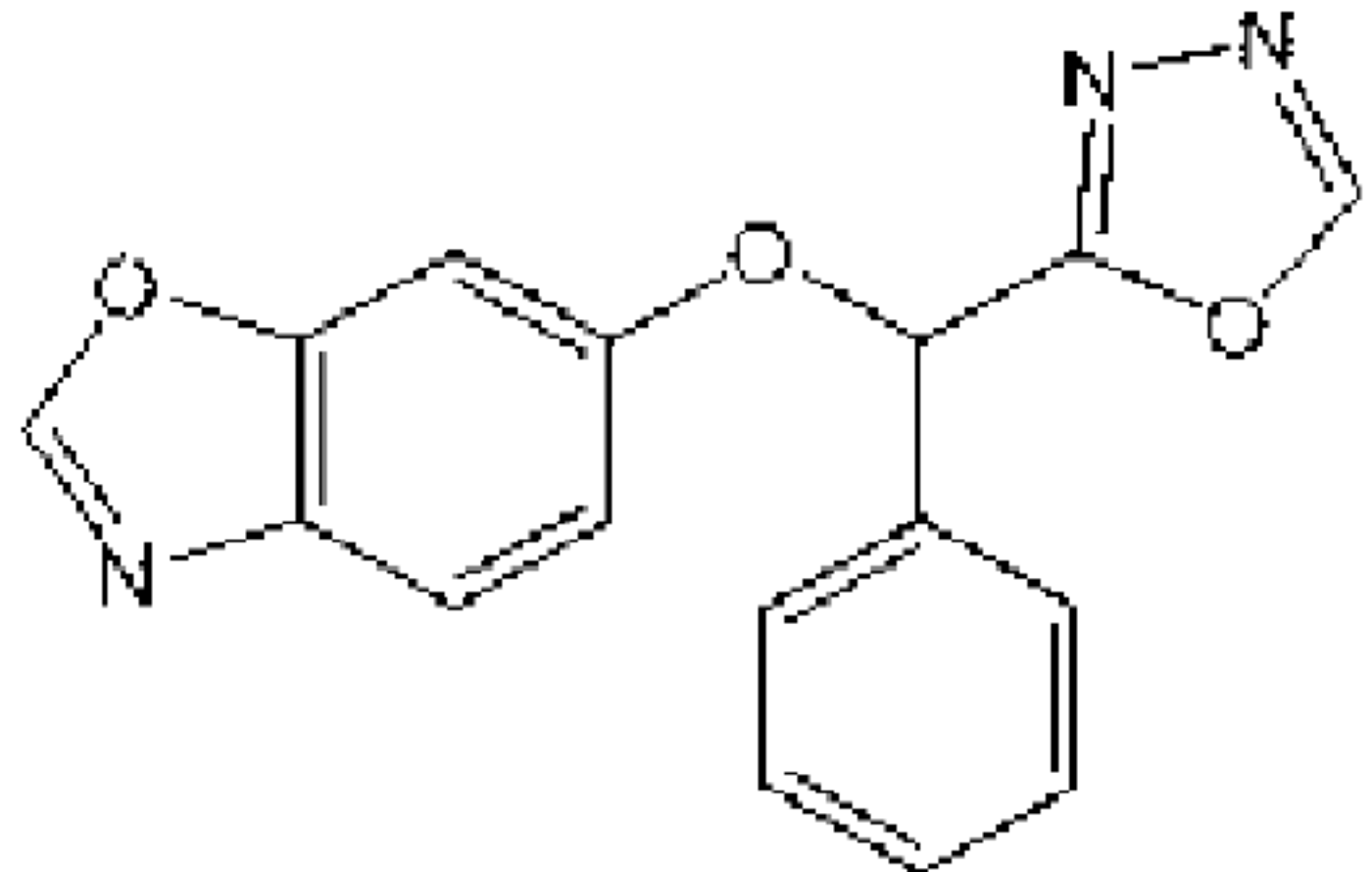
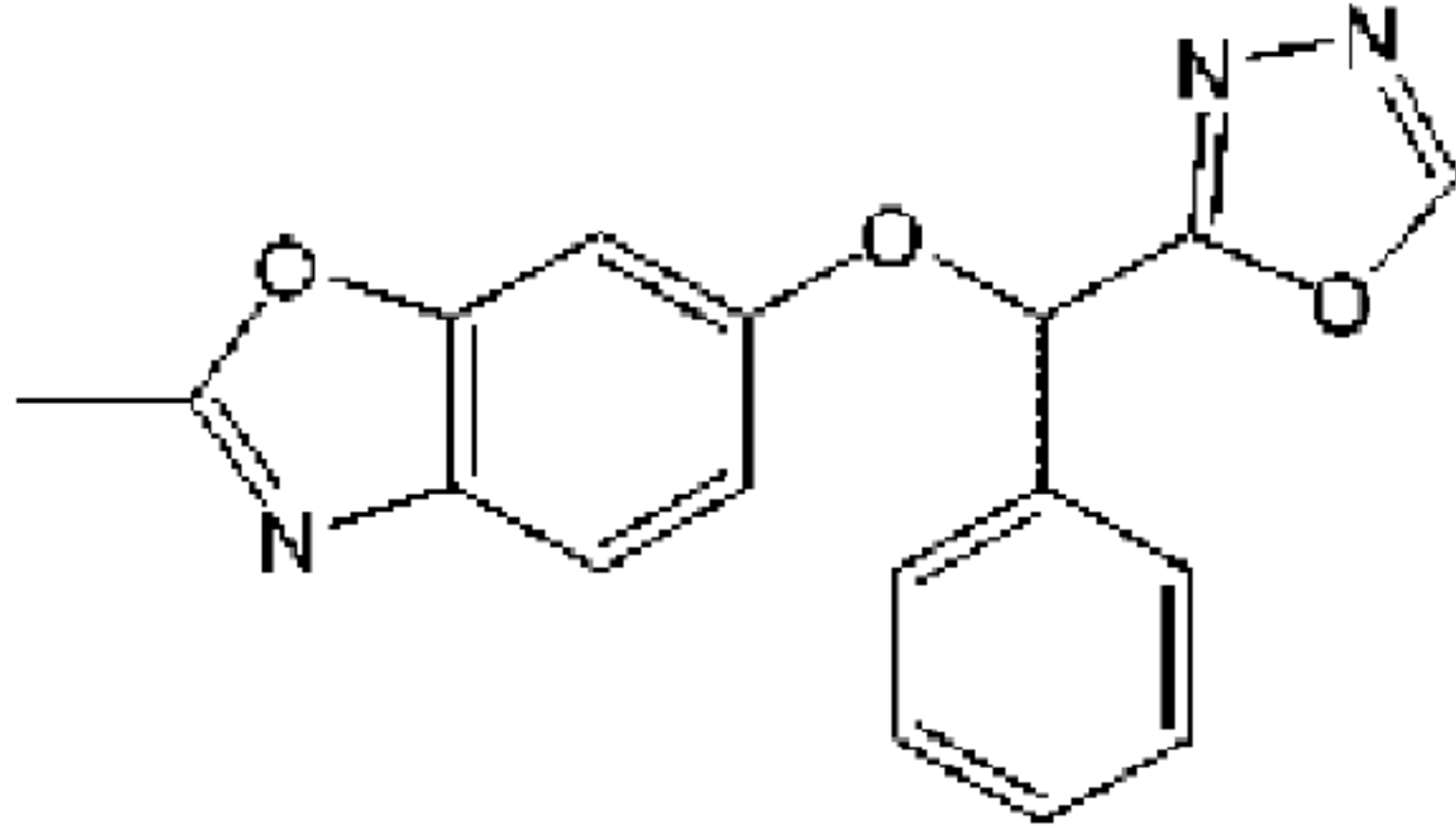
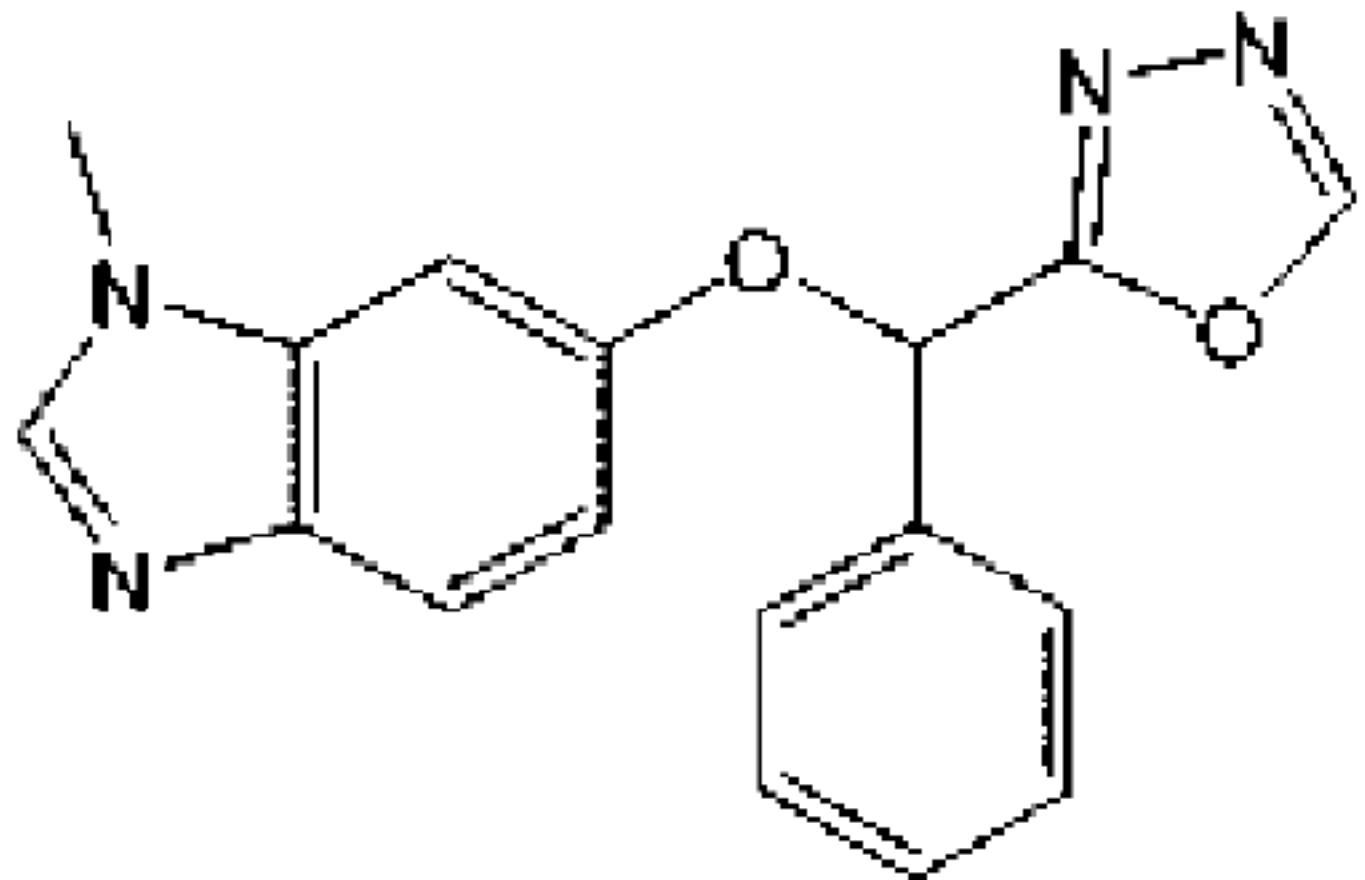
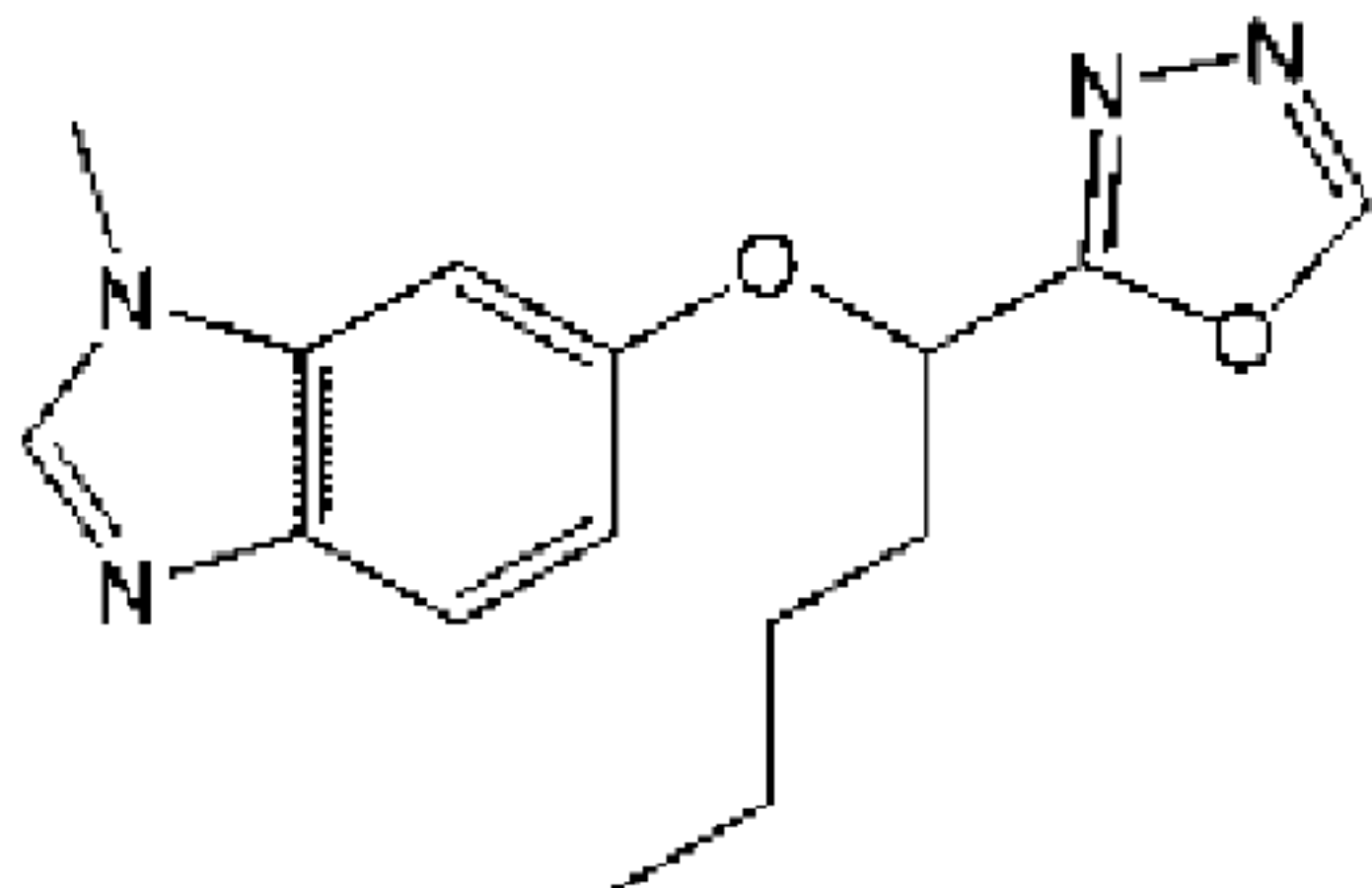
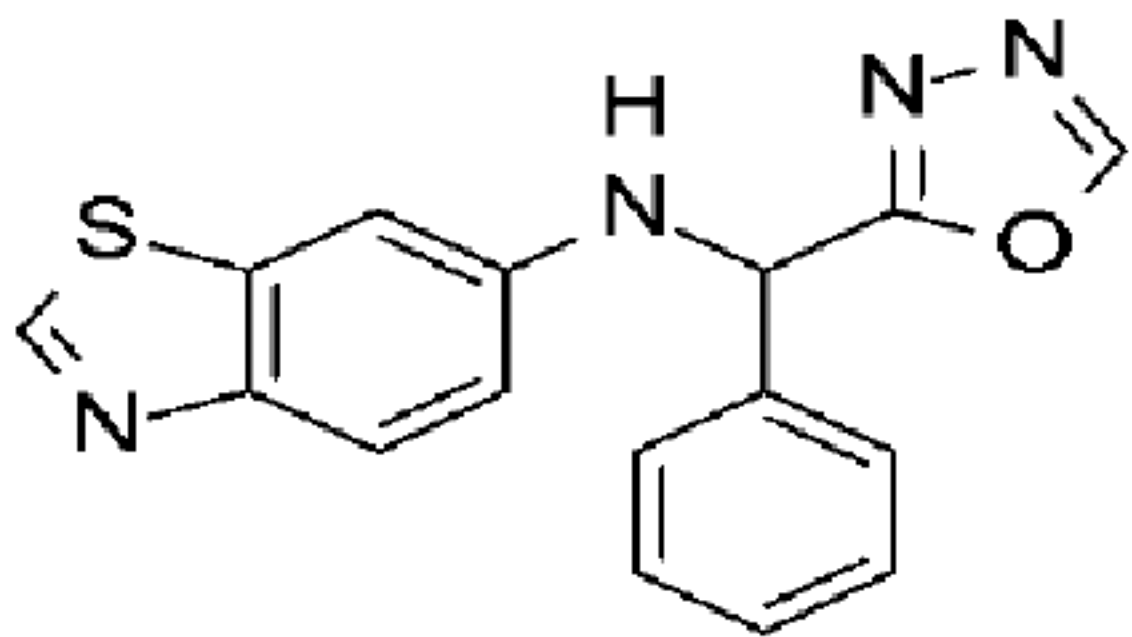
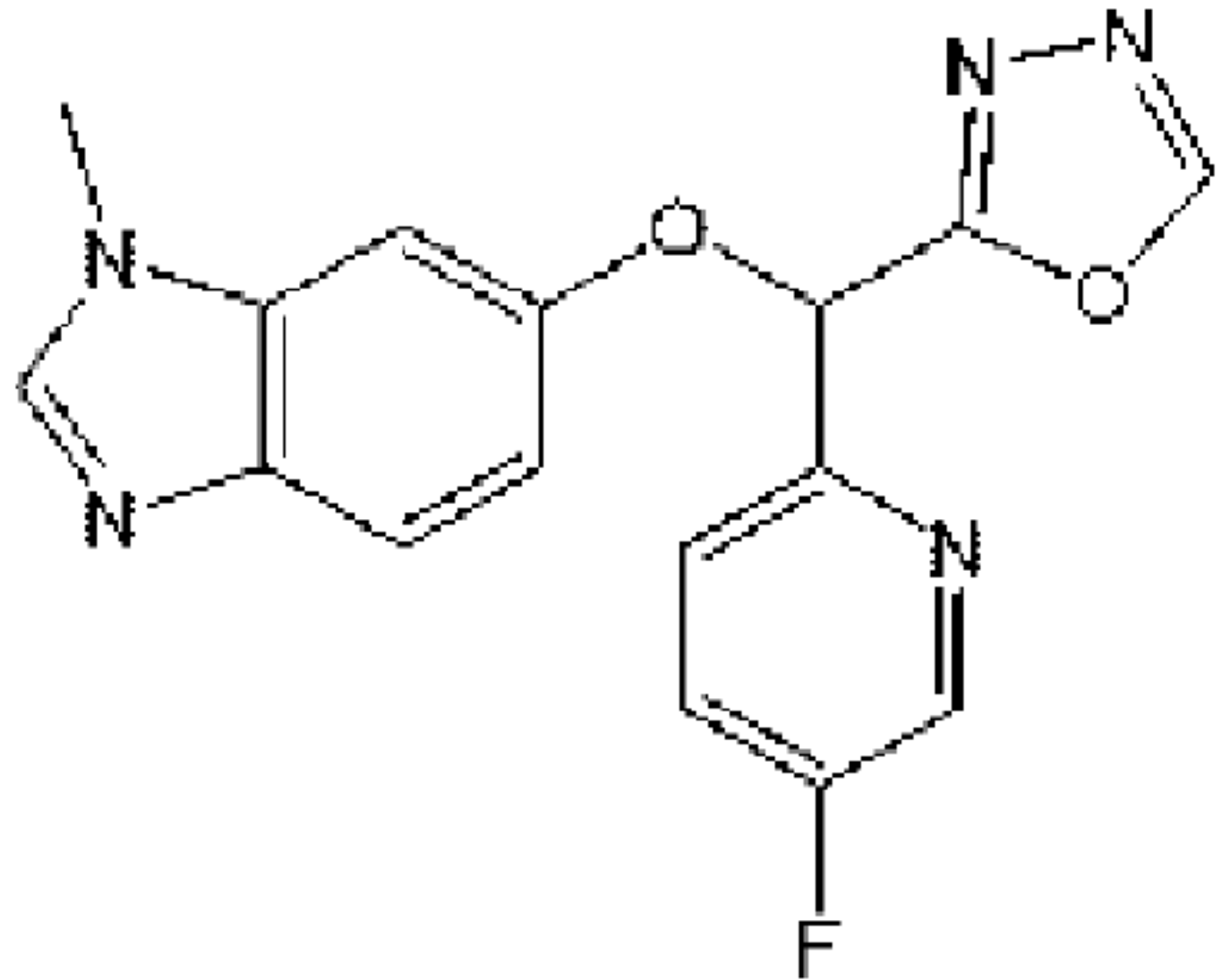
【0205】

表1（續）

化合物編號	R ¹	R ²	R ³	(X) _n	物性
a-180	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-烯丙基-5-F-吡啶-2-基	2-Me	m.p.：105-106℃
a-181	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(呋喃-3-基)吡啶-2-基	2-Me	n _D （20.5℃）1.5895
a-182	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-(3,5-Me ₂ -異噁唑-4-基)-5-F-吡啶-2-基	2-Me	m.p.：156-157℃
a-183	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(6-OMe-吡啶-3-基)吡啶-2-基	2-Me	非晶形
a-184	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(5-OMe-吡啶-3-基)吡啶-2-基	2-Me	m.p.：171-172℃
a-185	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(2-OMe-嘧啶-5-基)吡啶-2-基	2-Me	m.p.：157-158℃
a-186	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4- ⁿ Pr-吡啶-2-基	2-Me	m.p.：100-101℃
a-187	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(2-甲氧基乙基)吡啶-2-基	2-Me	m.p.：58-61℃
a-188	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(2-甲氧基乙基)吡啶-2-基	-	黏性油
a-189	H	1,3,4-噁二唑-2-基	5-F-4-(2-甲氧基乙基)吡啶-2-基	2- ^o Pr	黏性油
a-190	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	-	黏性油
a-191	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2- ^o Pr	m.p.：109-111℃
a-192	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-(丙-1-烯-2-基)	m.p.：100-102℃
a-193	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	2-Me-4-Et	黏性油
a-194	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-((甲氧基甲氧基)甲基)吡啶-2-基	4-OMe	黏性油
a-195	H	1,3,4-噁二唑-2-基	4-CH ₂ OH-5-F-吡啶-2-基	2- ^o Pr	m.p.：127-128℃

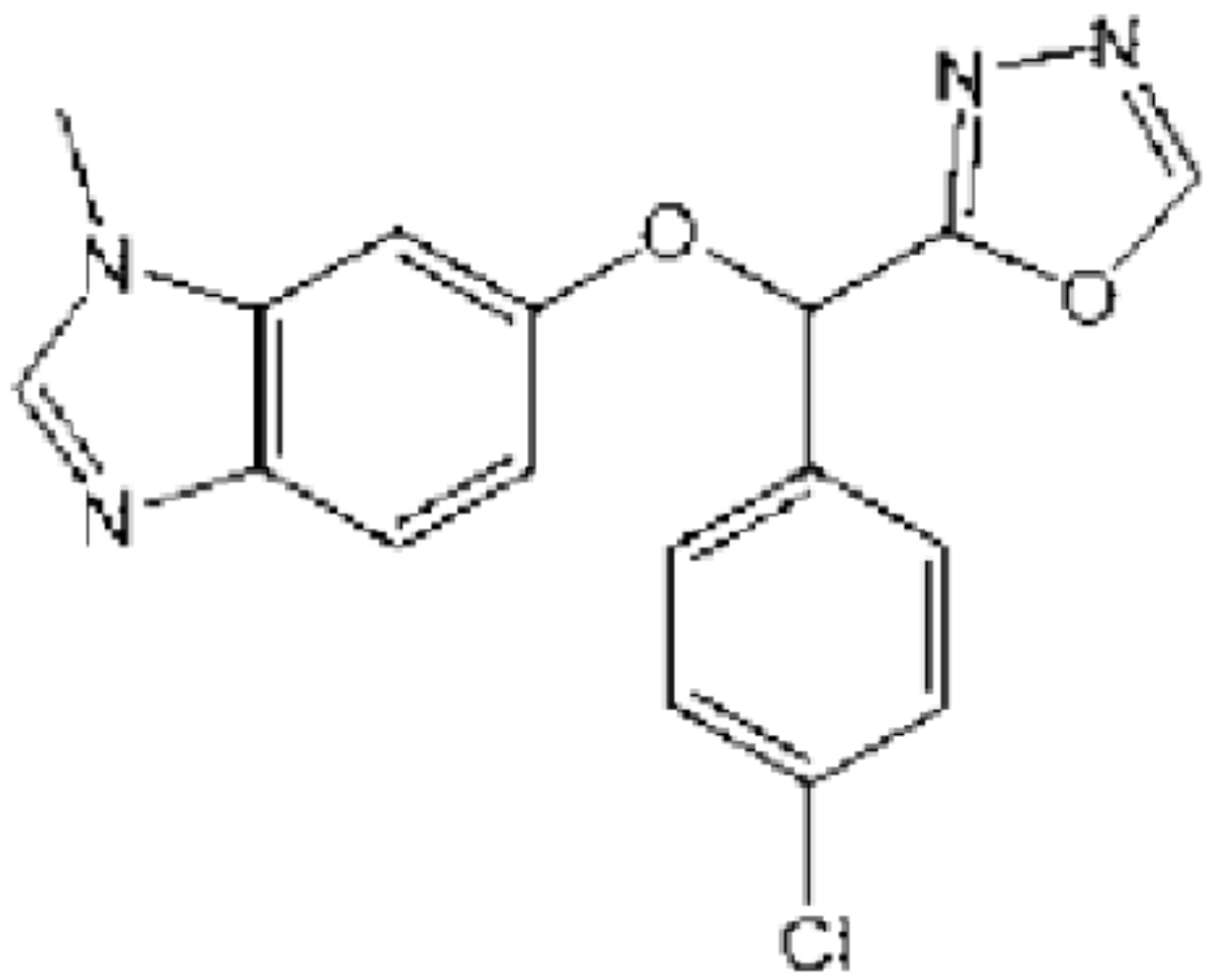
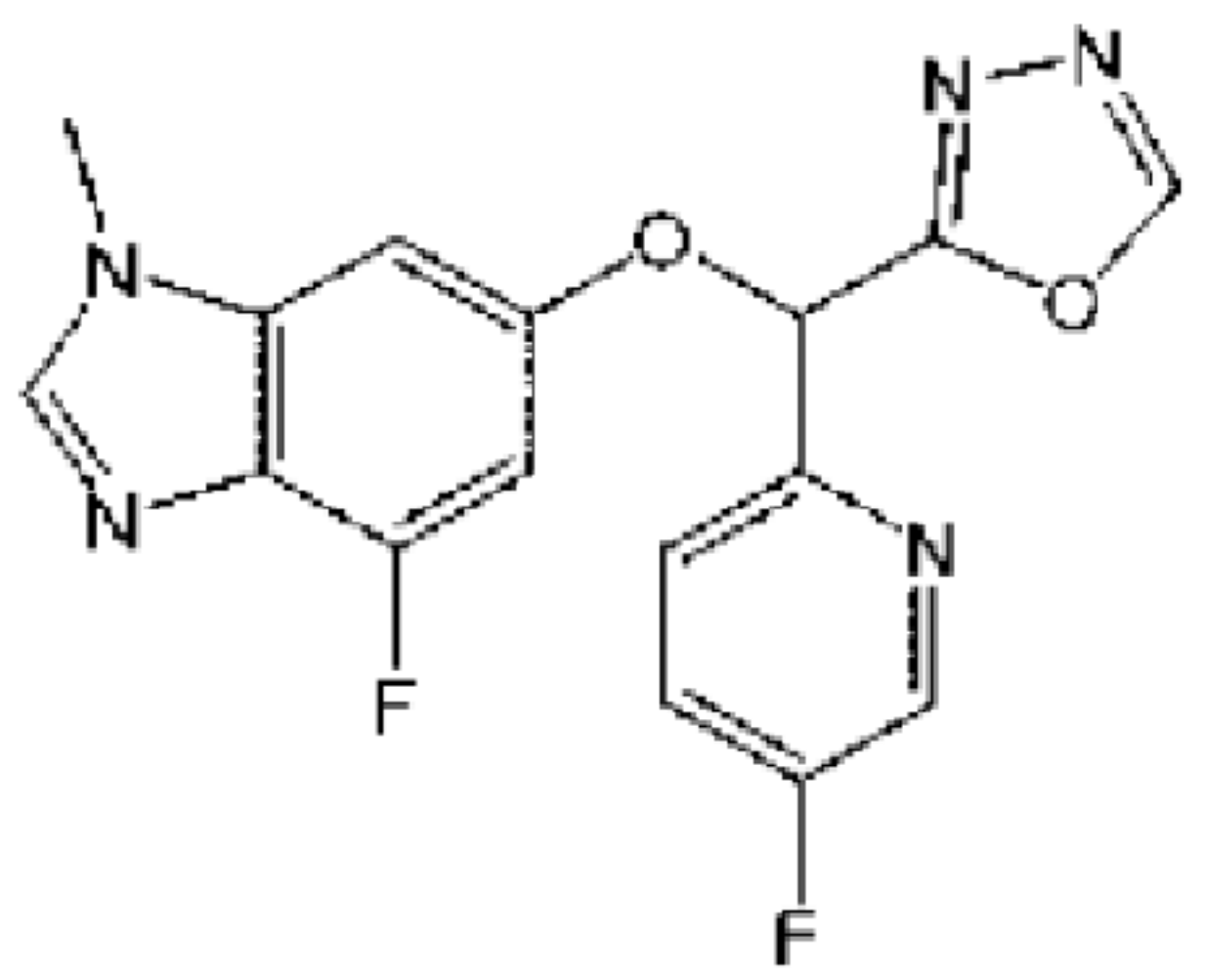
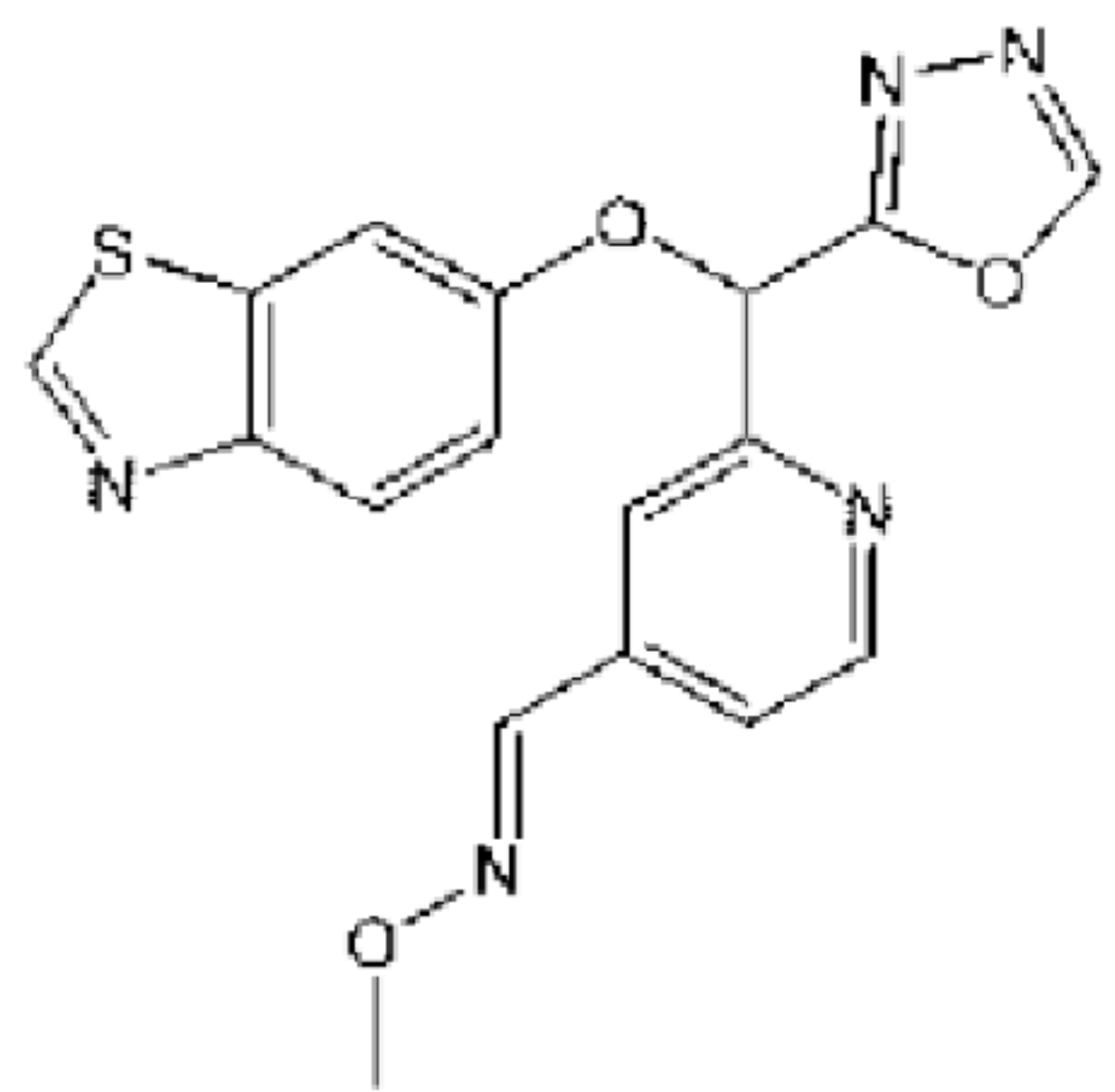
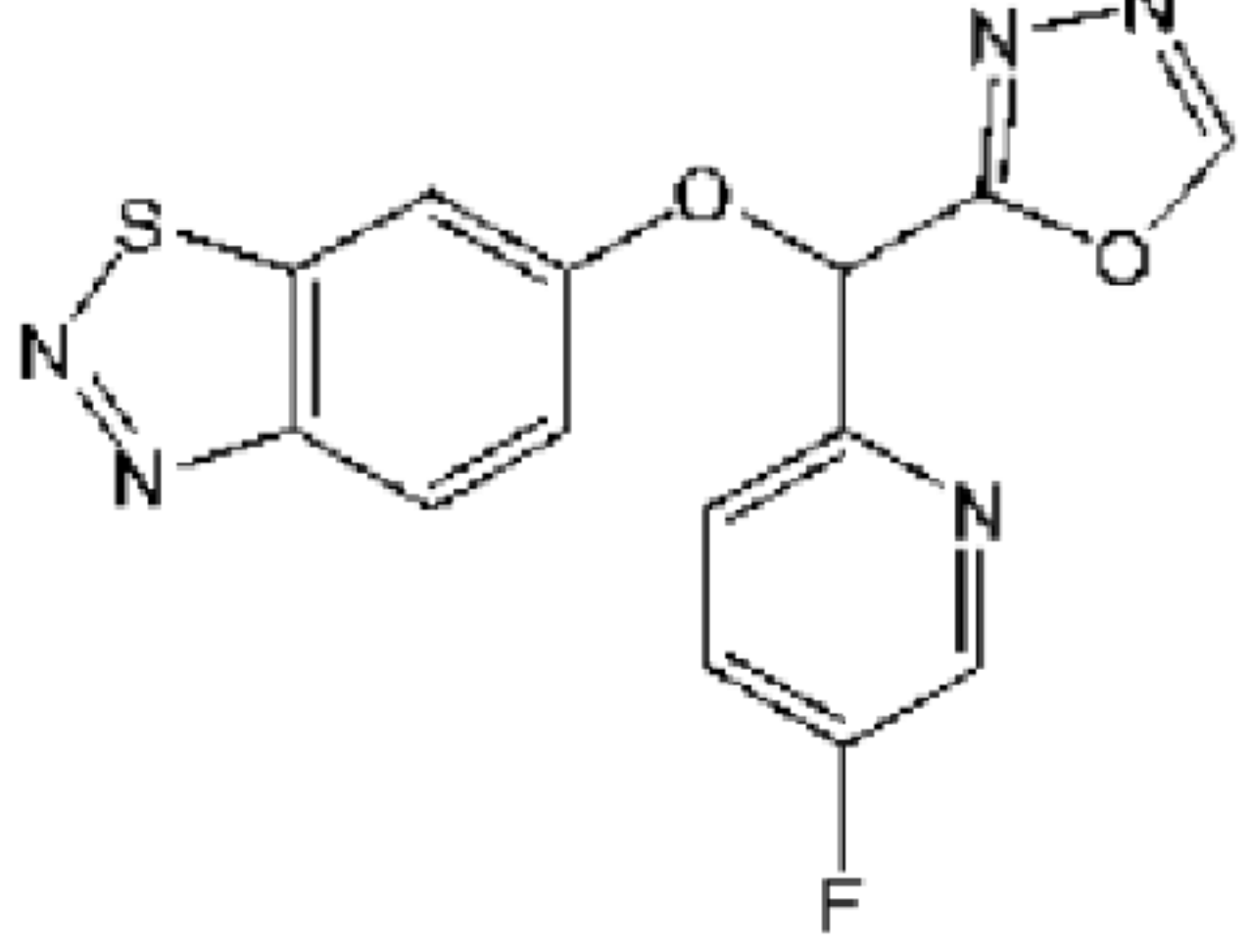
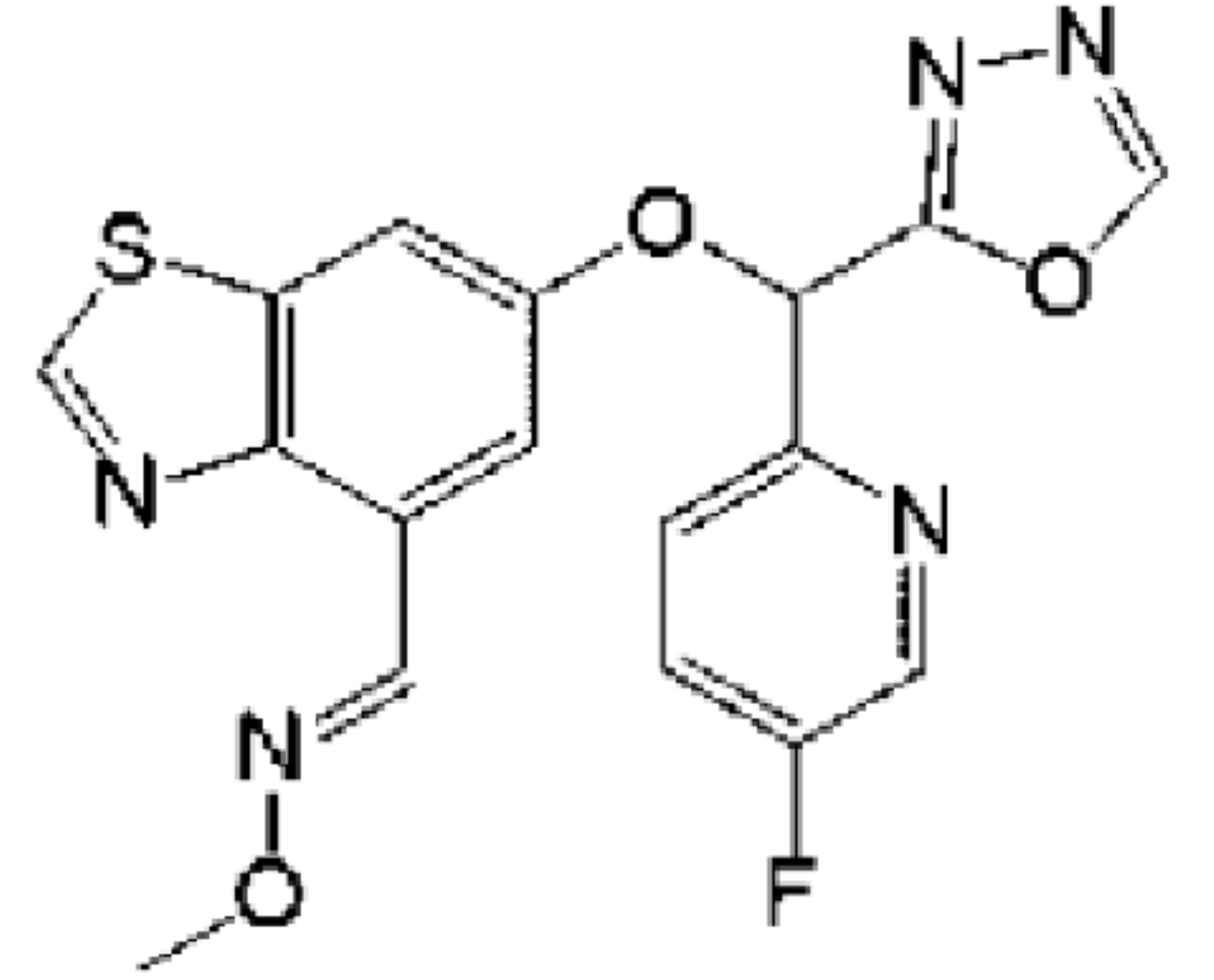
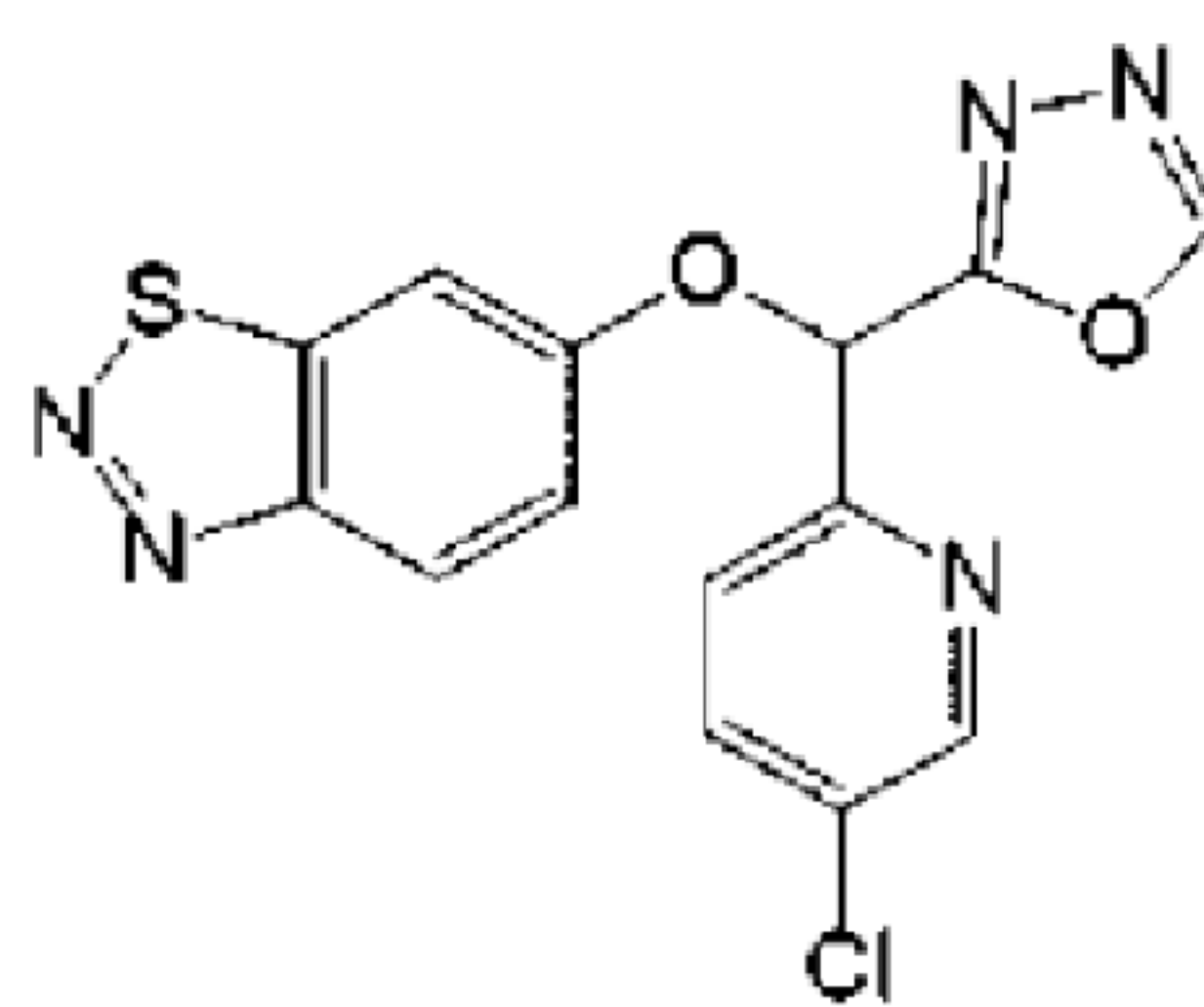
【0206】

表2

化合物 編號	結構	物性
b-1		m.p. : 113-115°C
b-2		m.p. : 94-96°C
b-3		m.p. : 114-116°C
b-4		非晶形
b-5		非晶形
b-6		黏性油

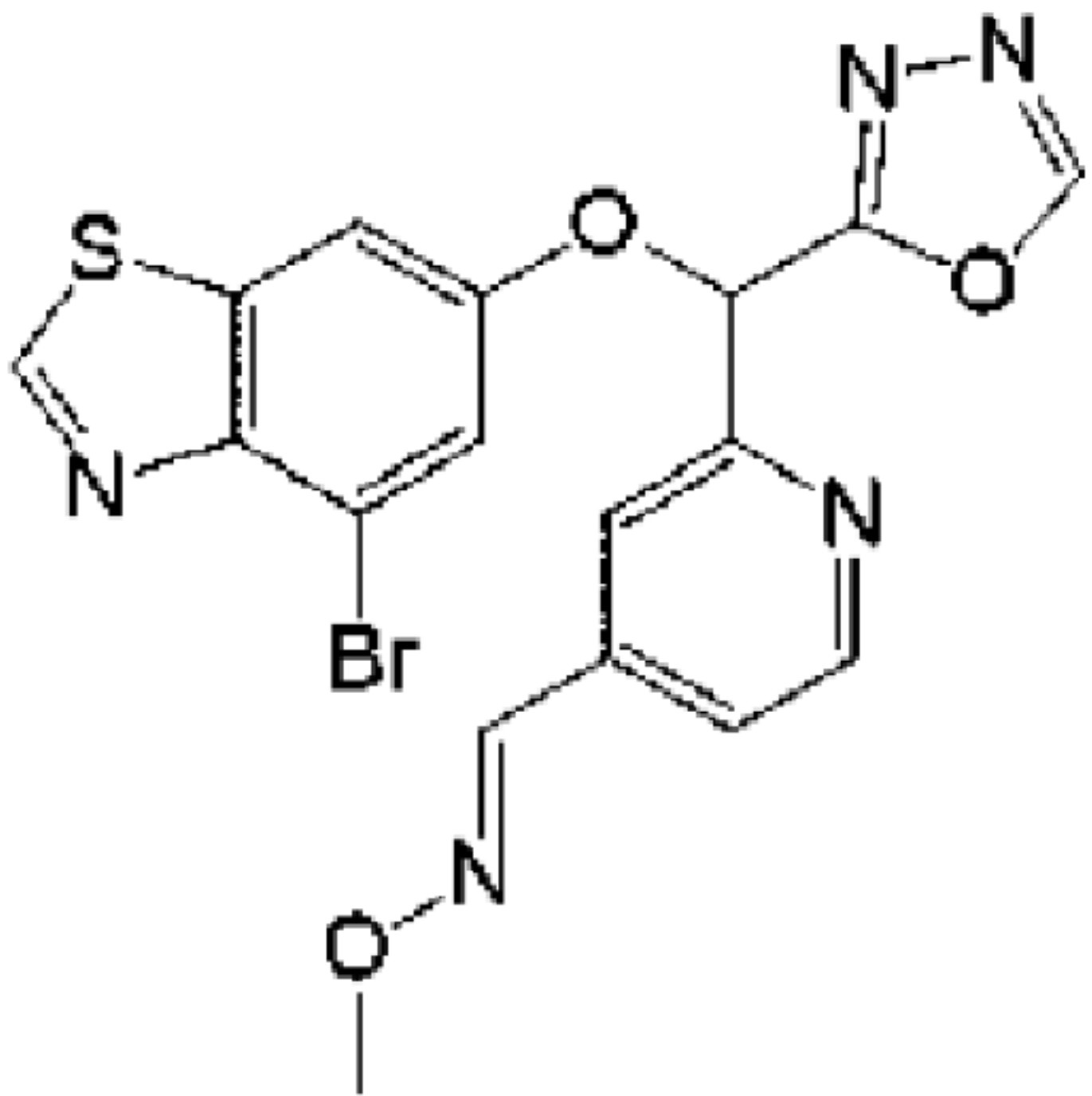
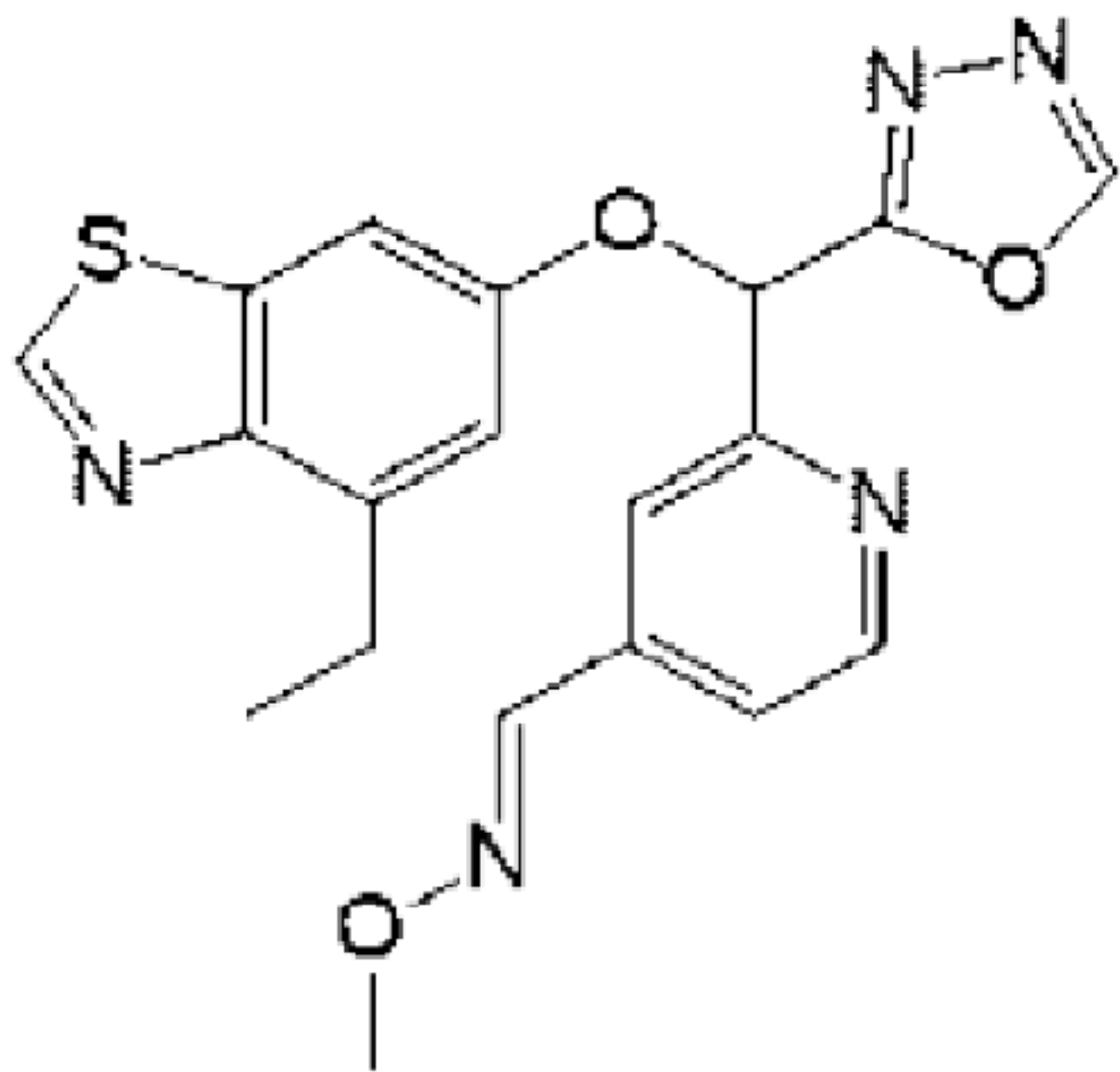
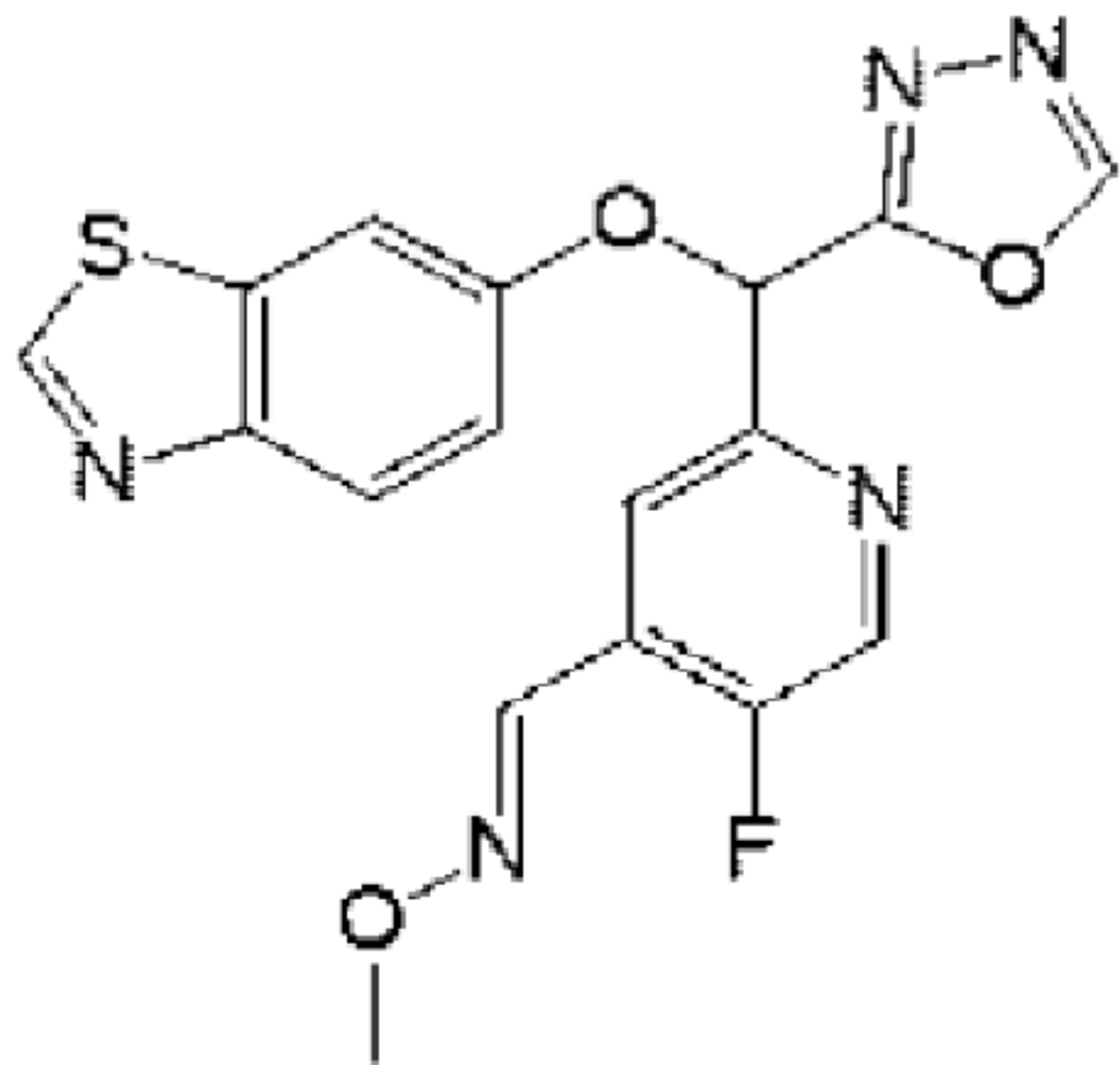
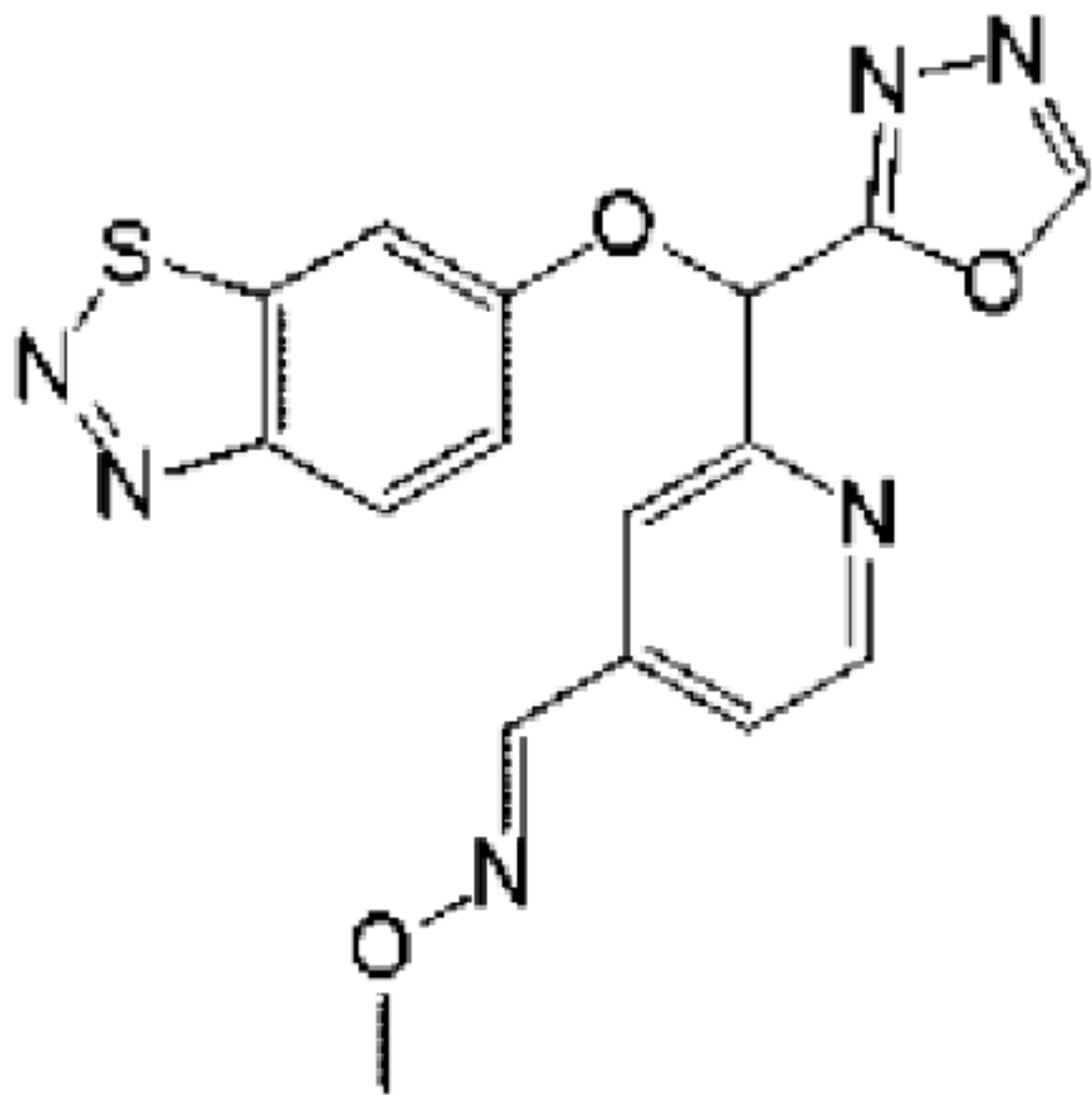
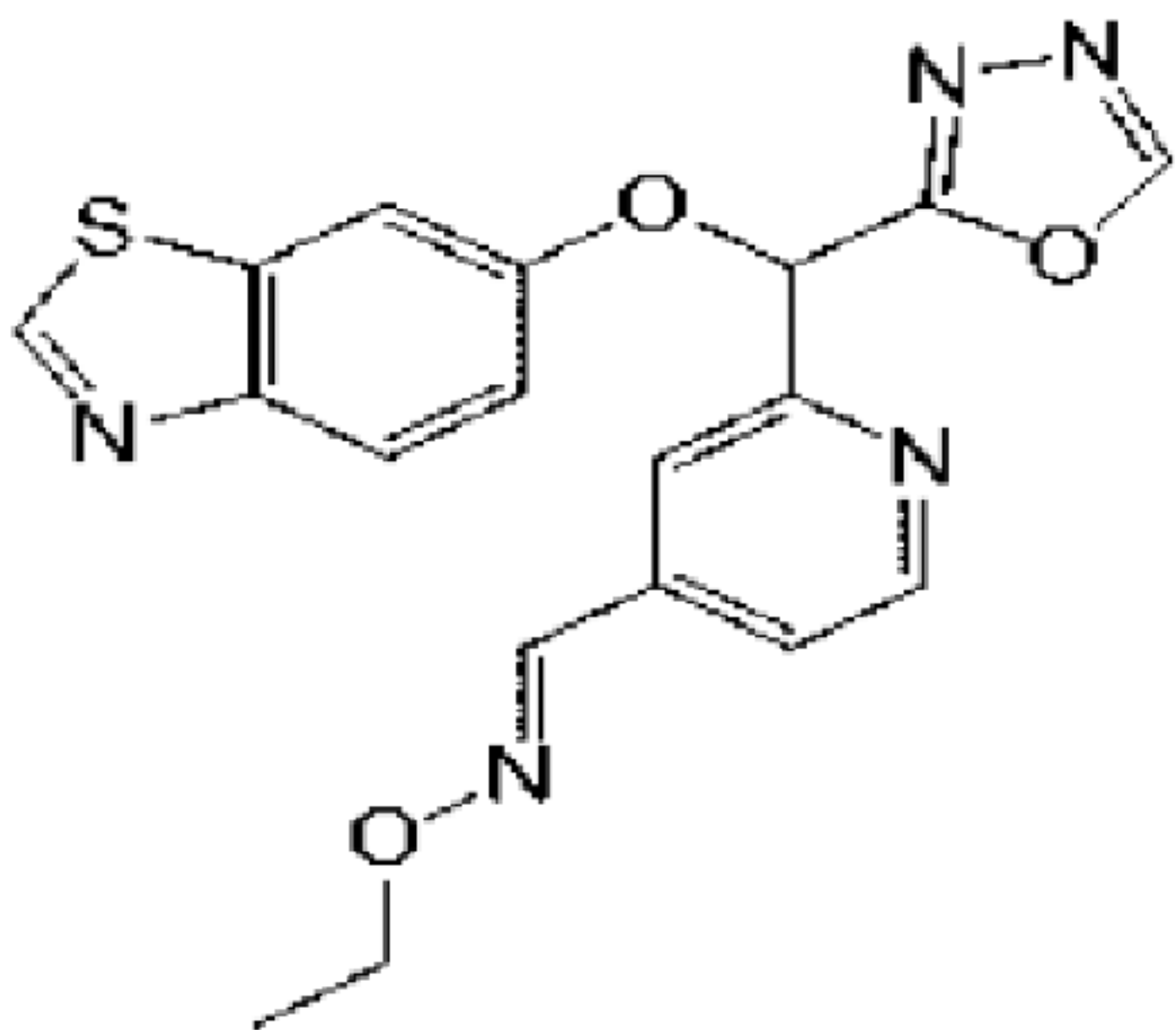
【0207】

表2（續）

化合物 編號	結構	物性
b-7		黏性油
b-8		黏性油
b-9		黏性油
b-10		m.p. : 141-142°C
b-11		m.p. : 165-167°C
b-12		m.p. : 133-134°C

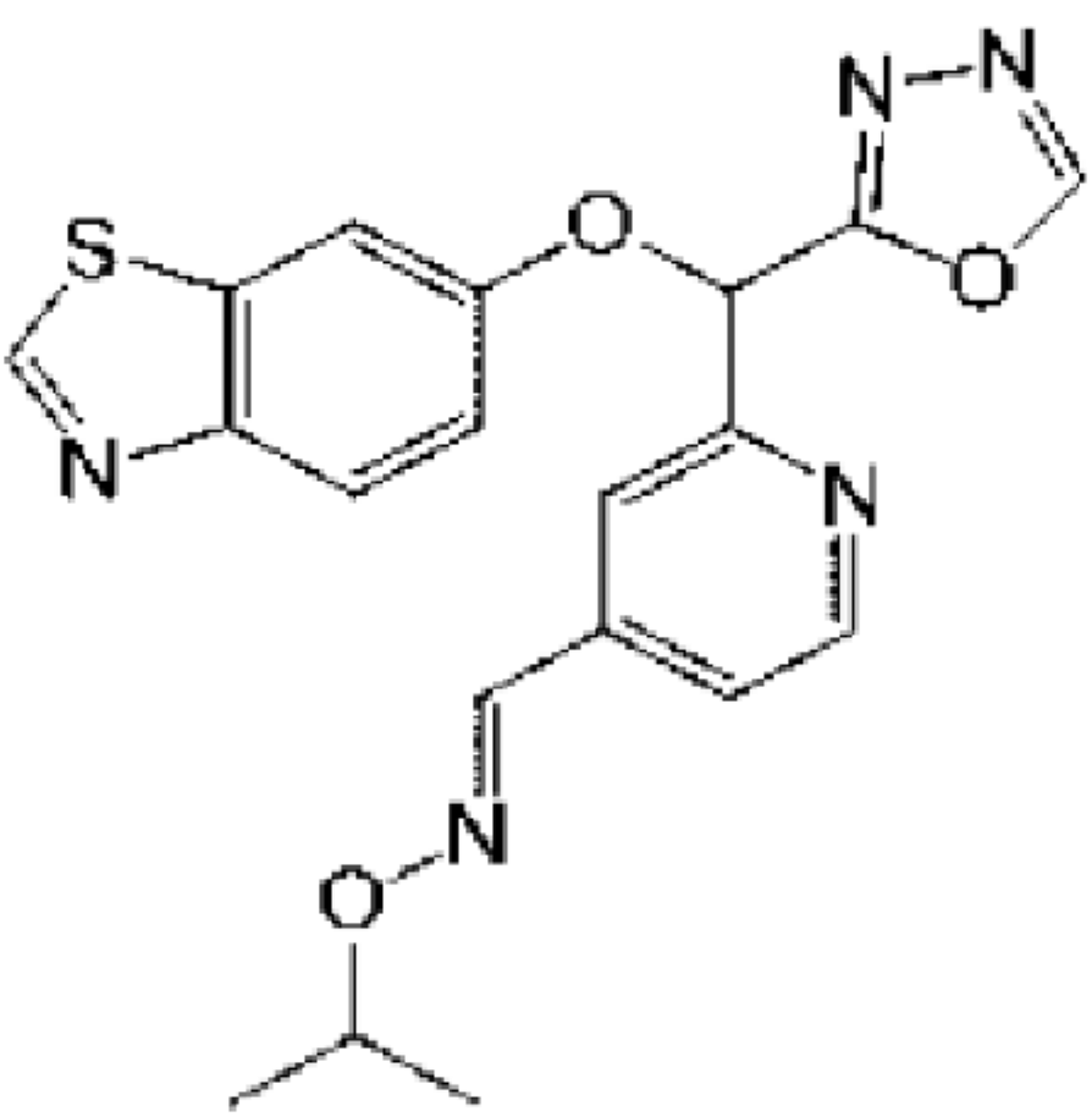
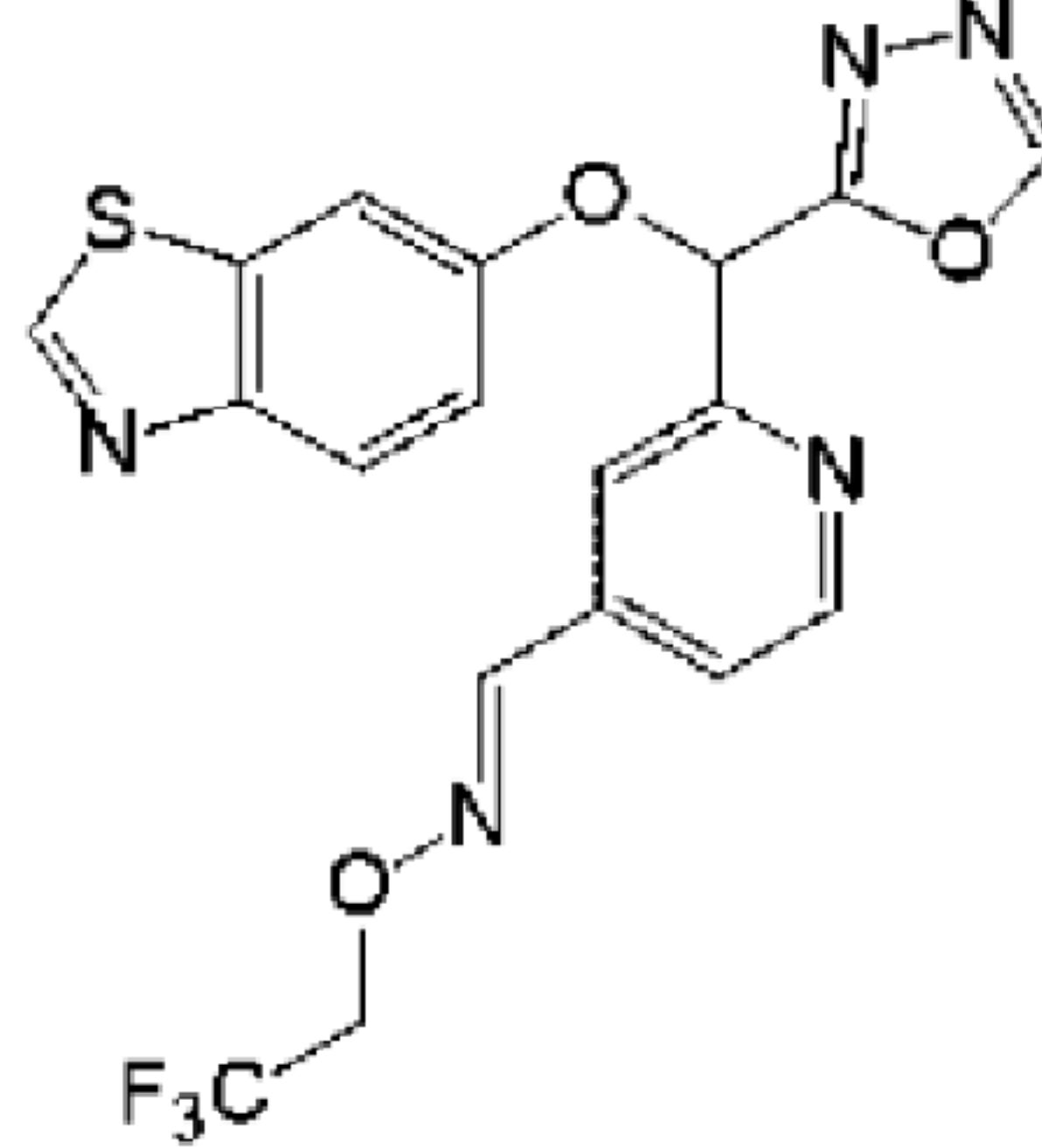
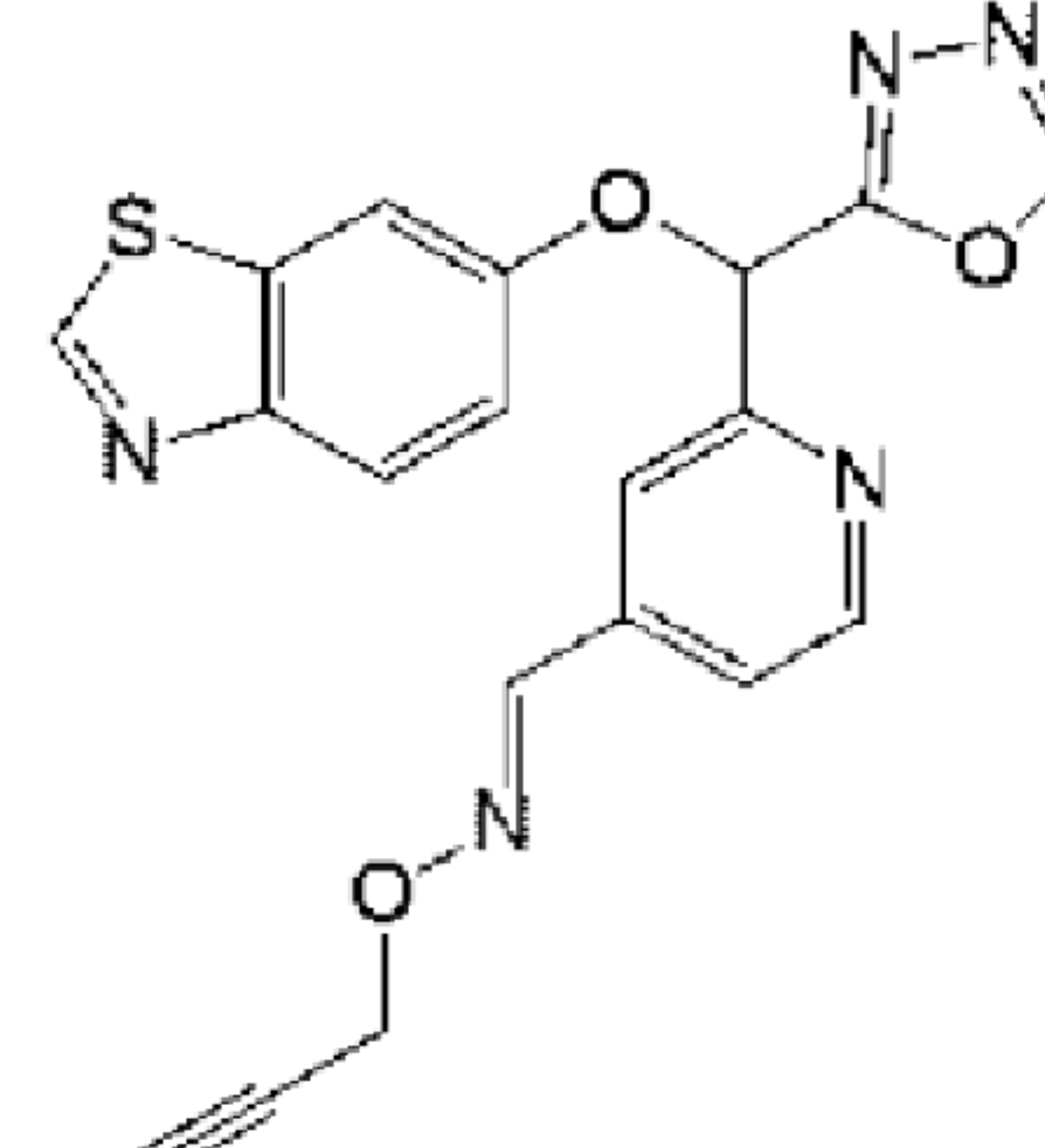
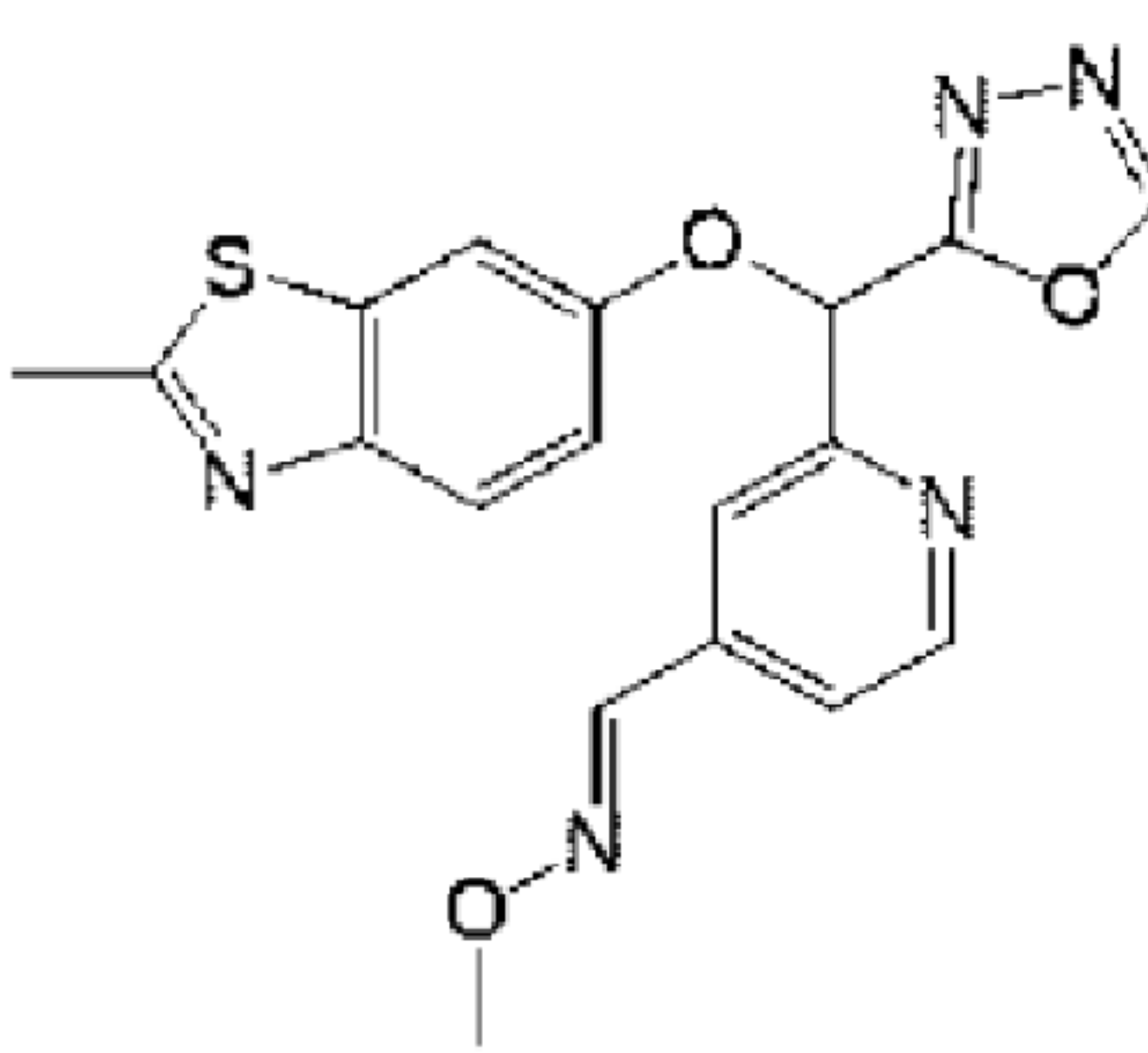
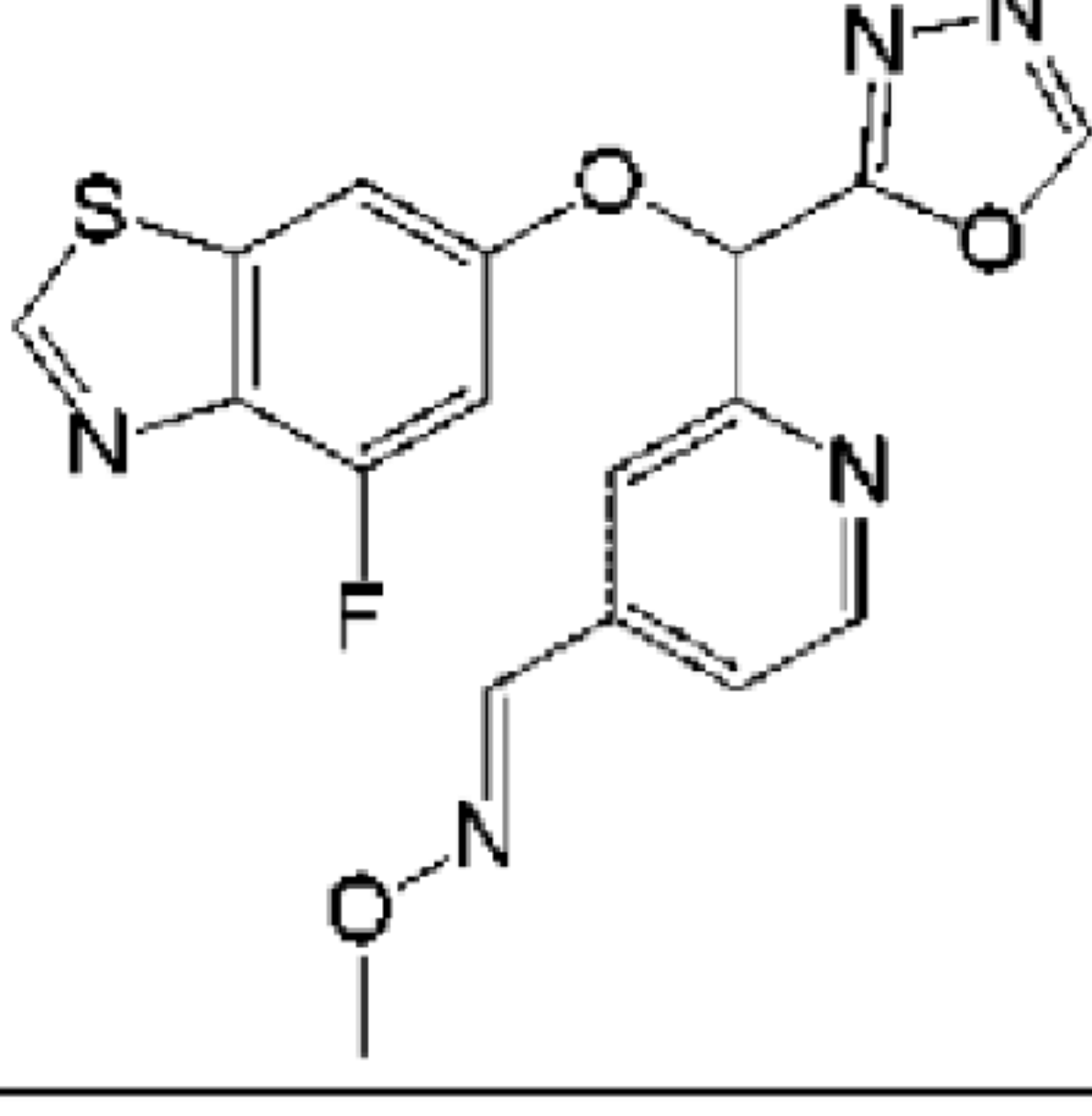
【0208】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-13		非晶形
b-14		黏性油
b-15		m.p. : 136-138°C
b-16		m.p. : 172-173°C
b-17		m.p. : 113-114°C

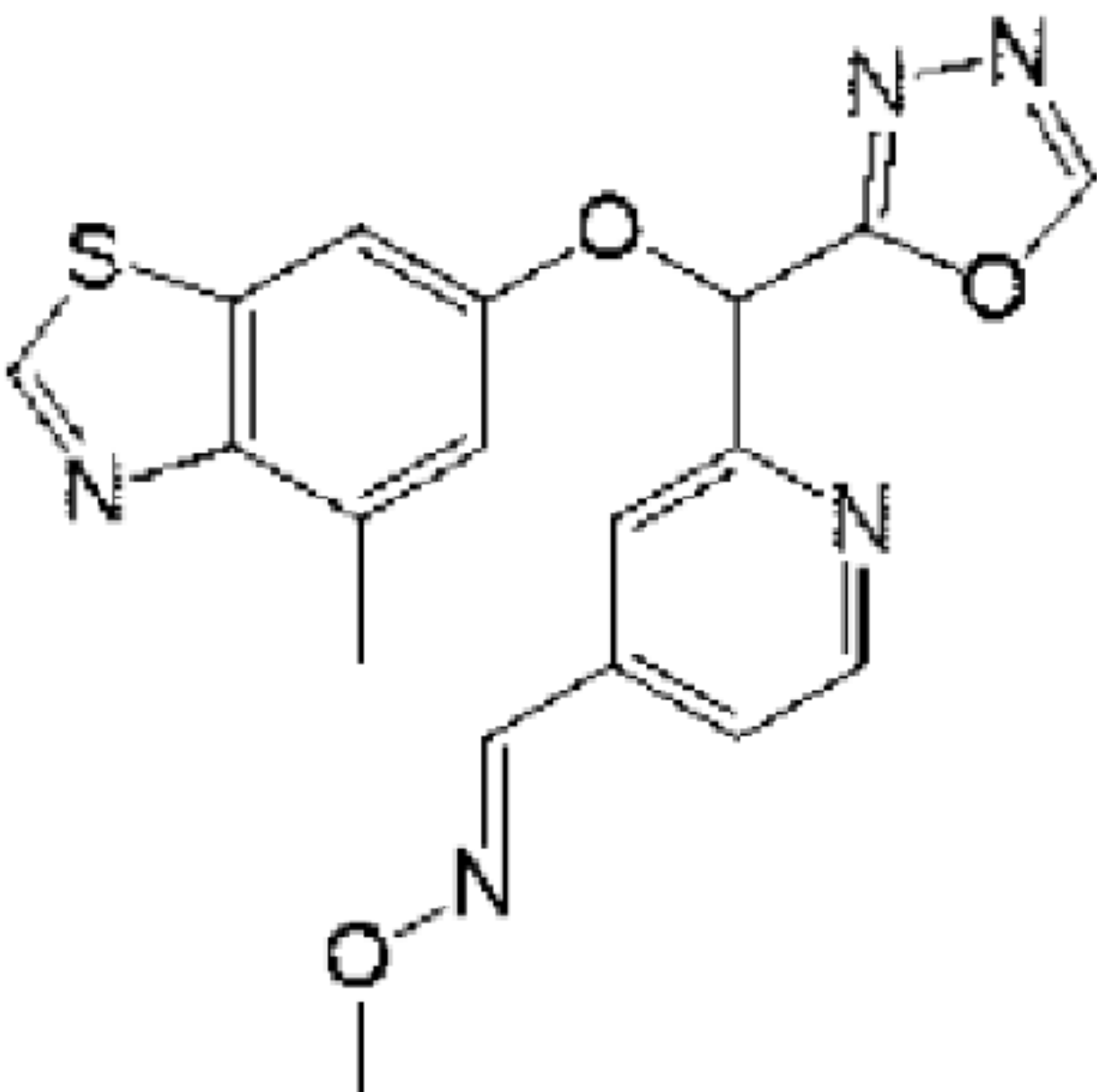
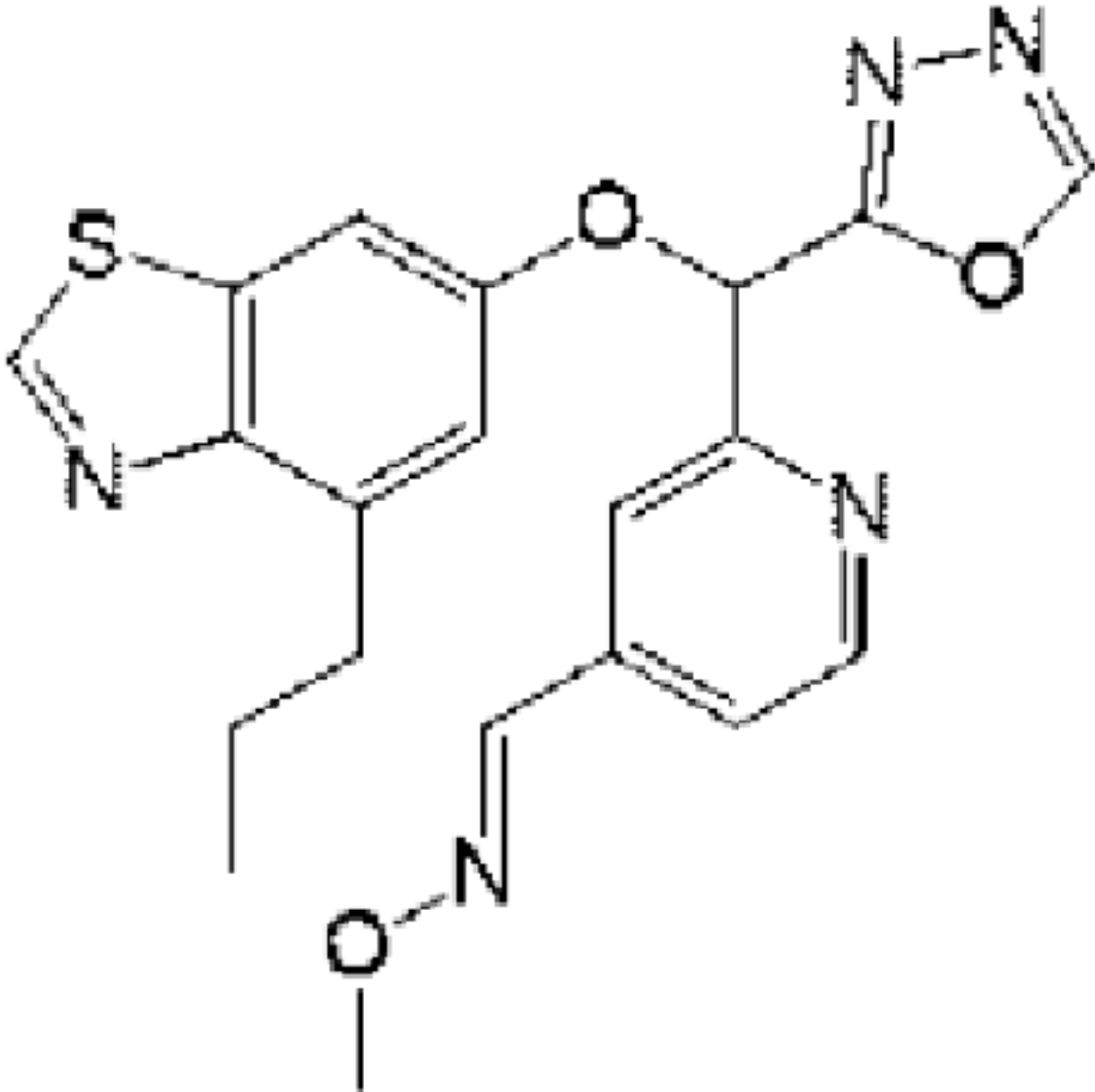
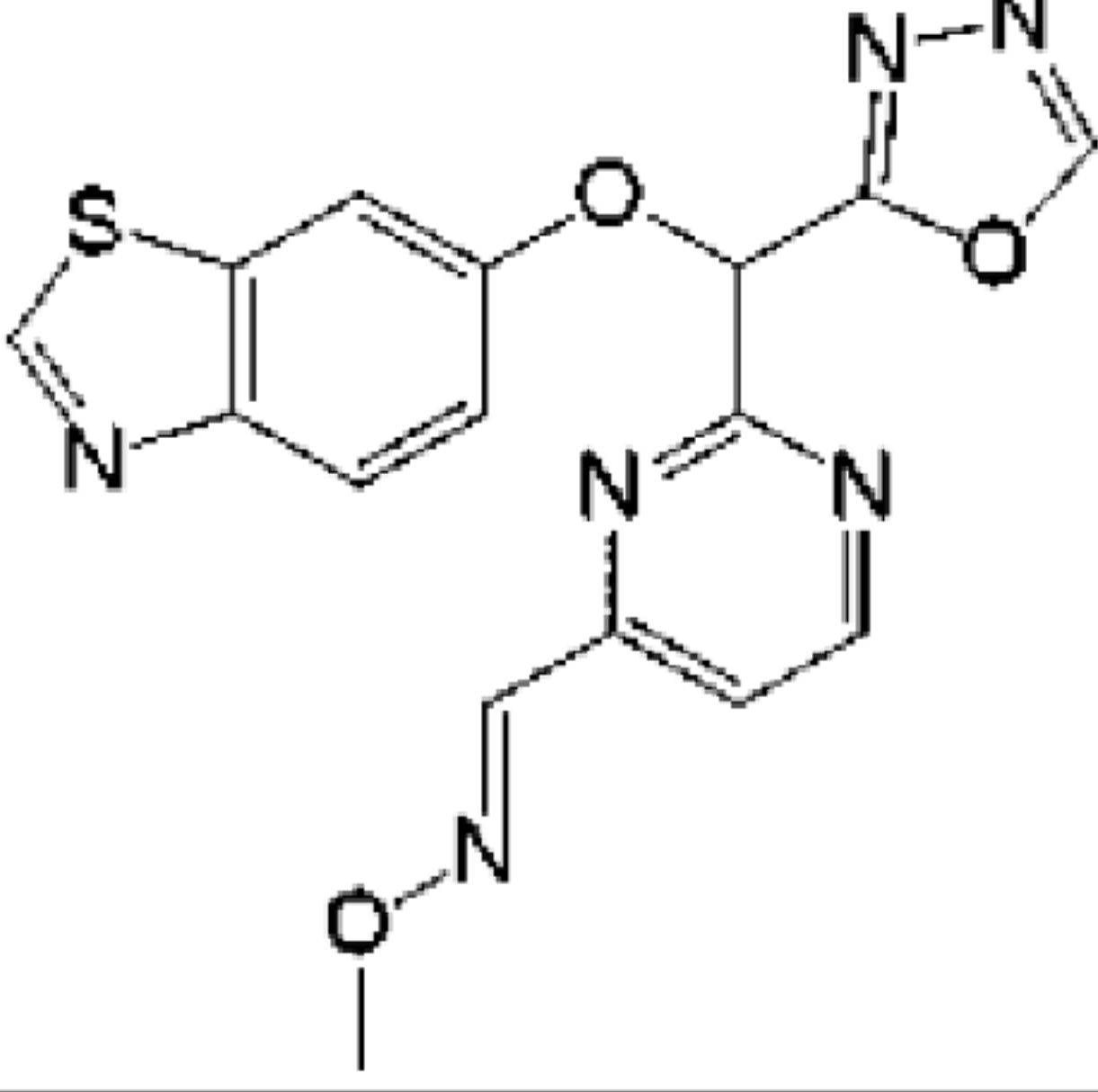
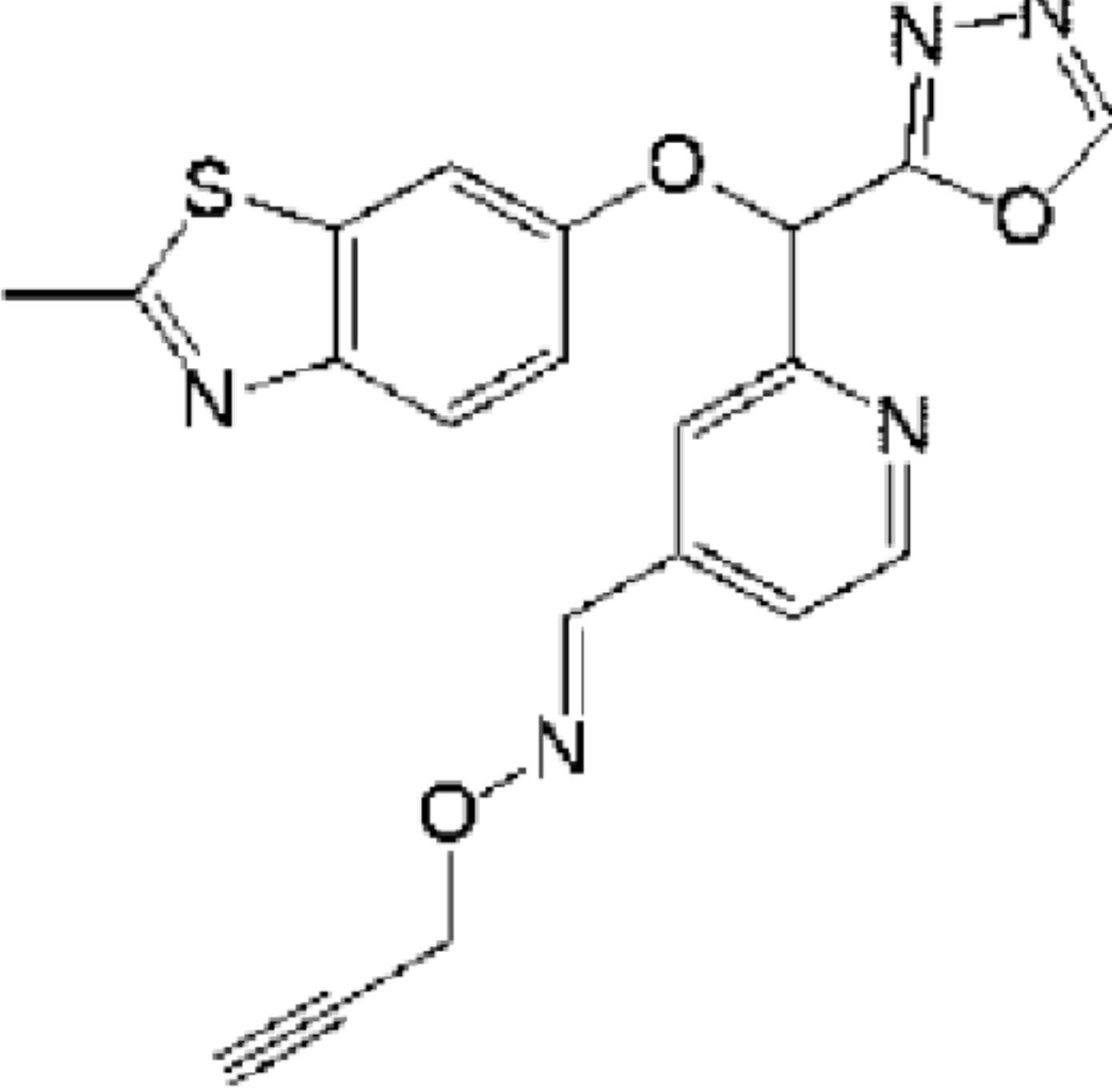
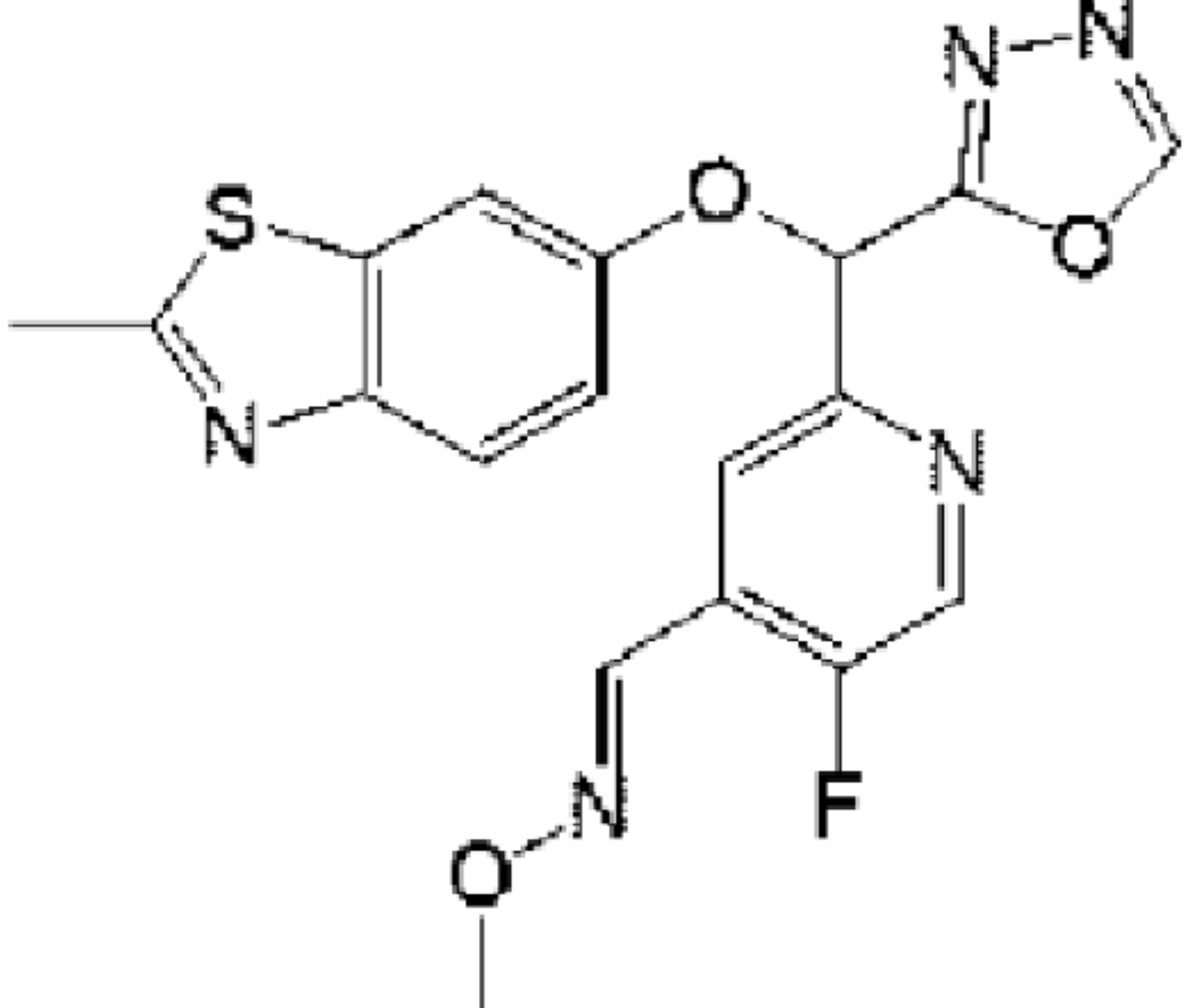
【0209】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-18		黏性油
b-19		m.p. : 128-130°C
b-20		黏性油
b-21		m.p. : 107-109°C
b-22		m.p. : 146-148°C

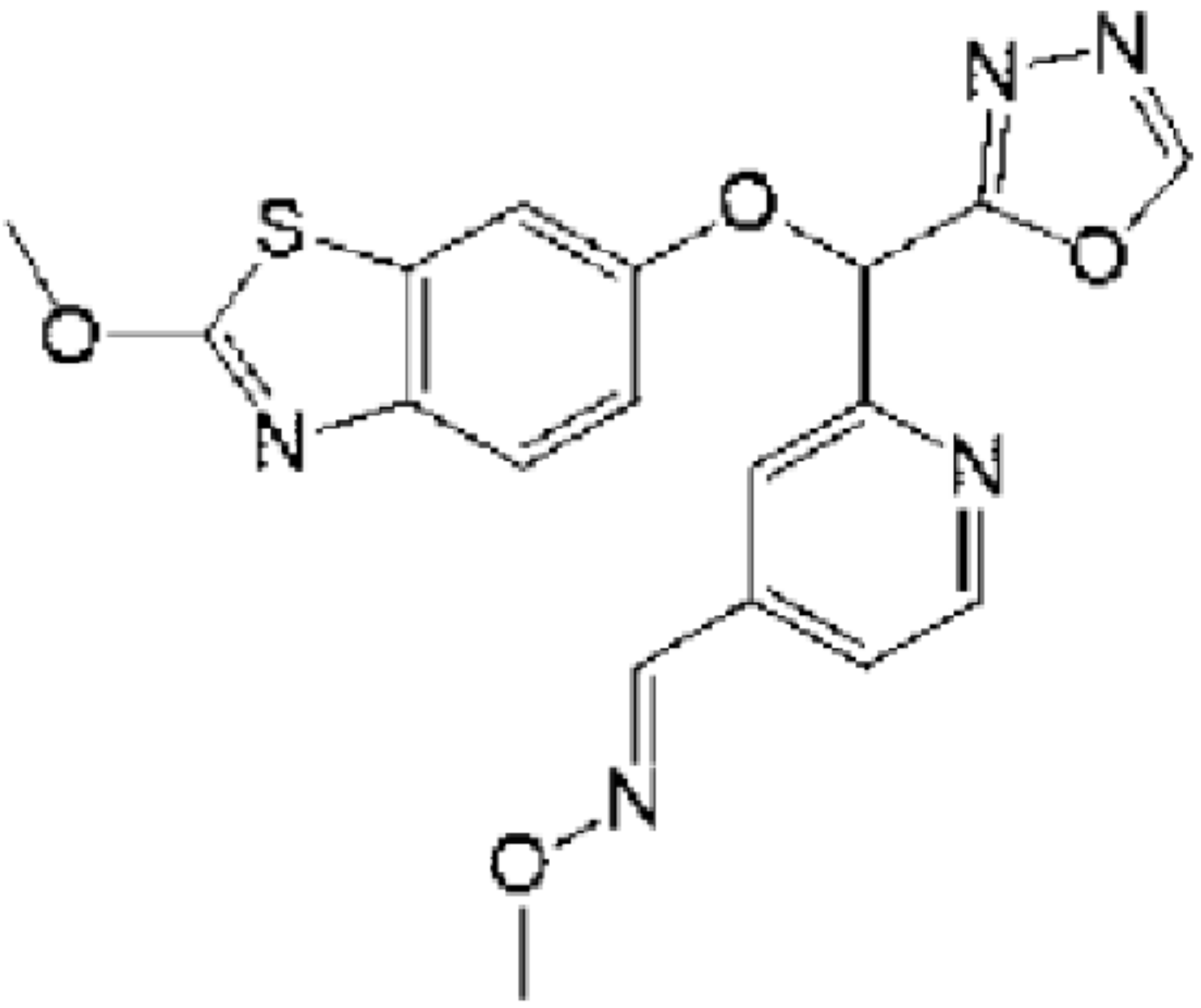
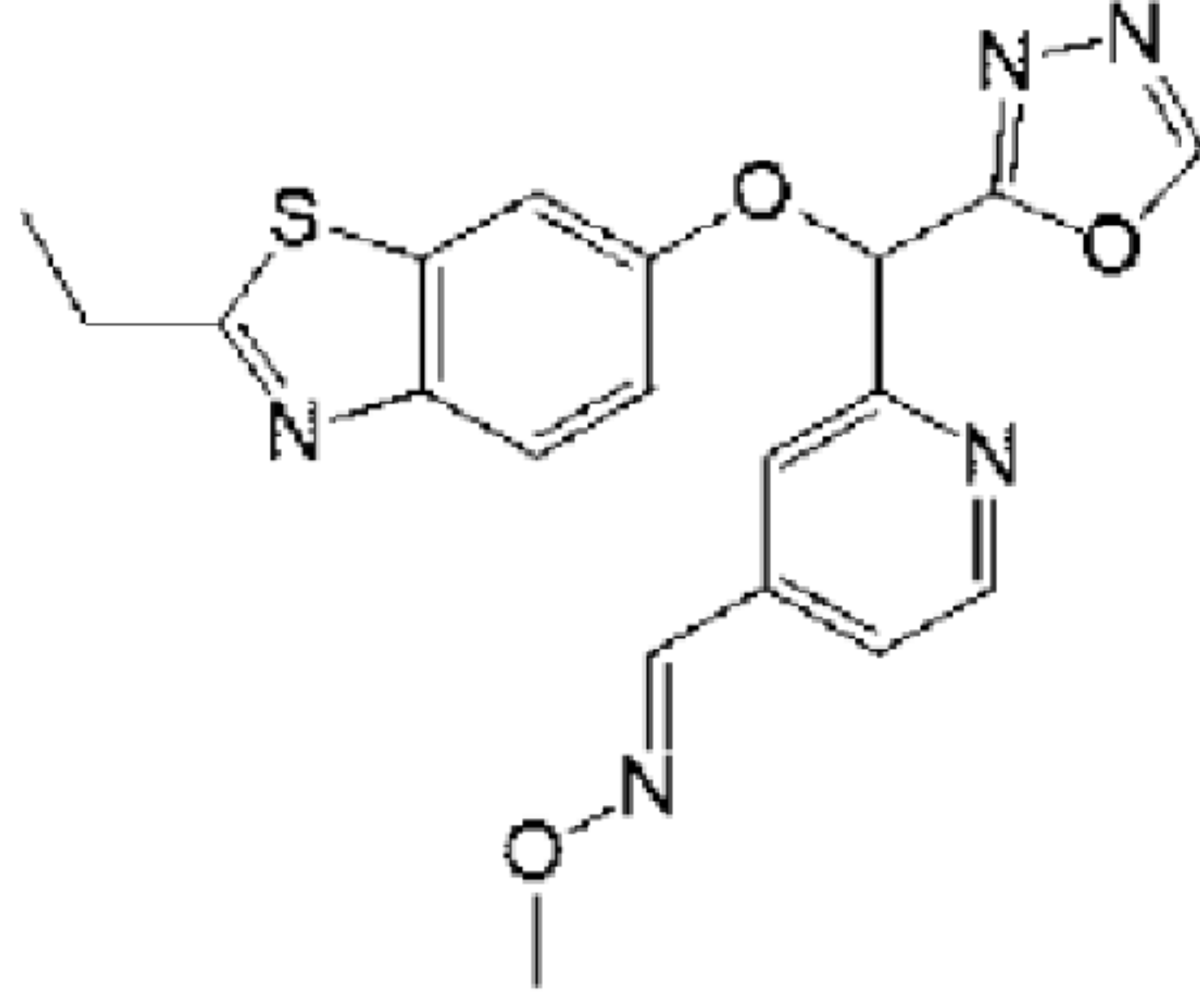
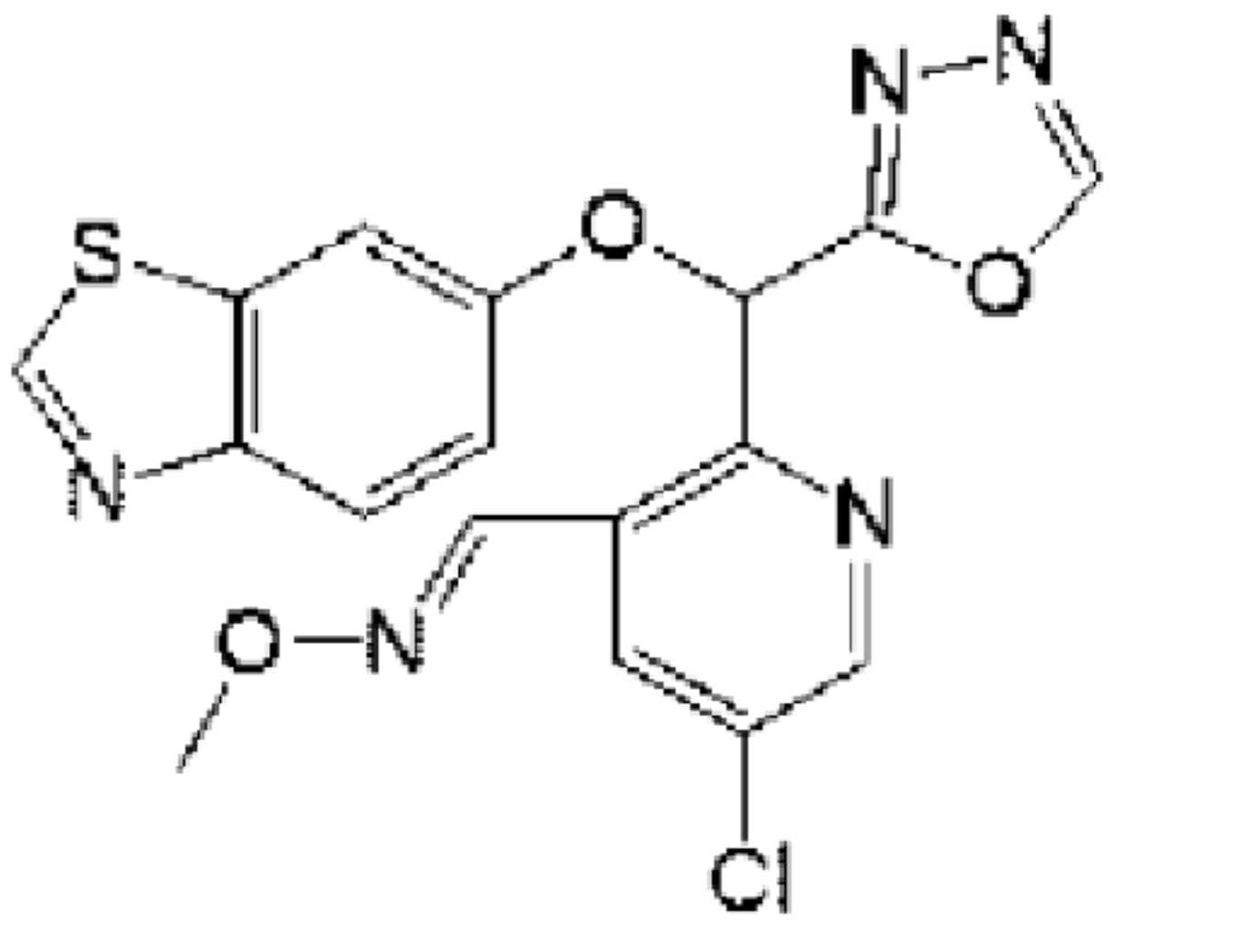
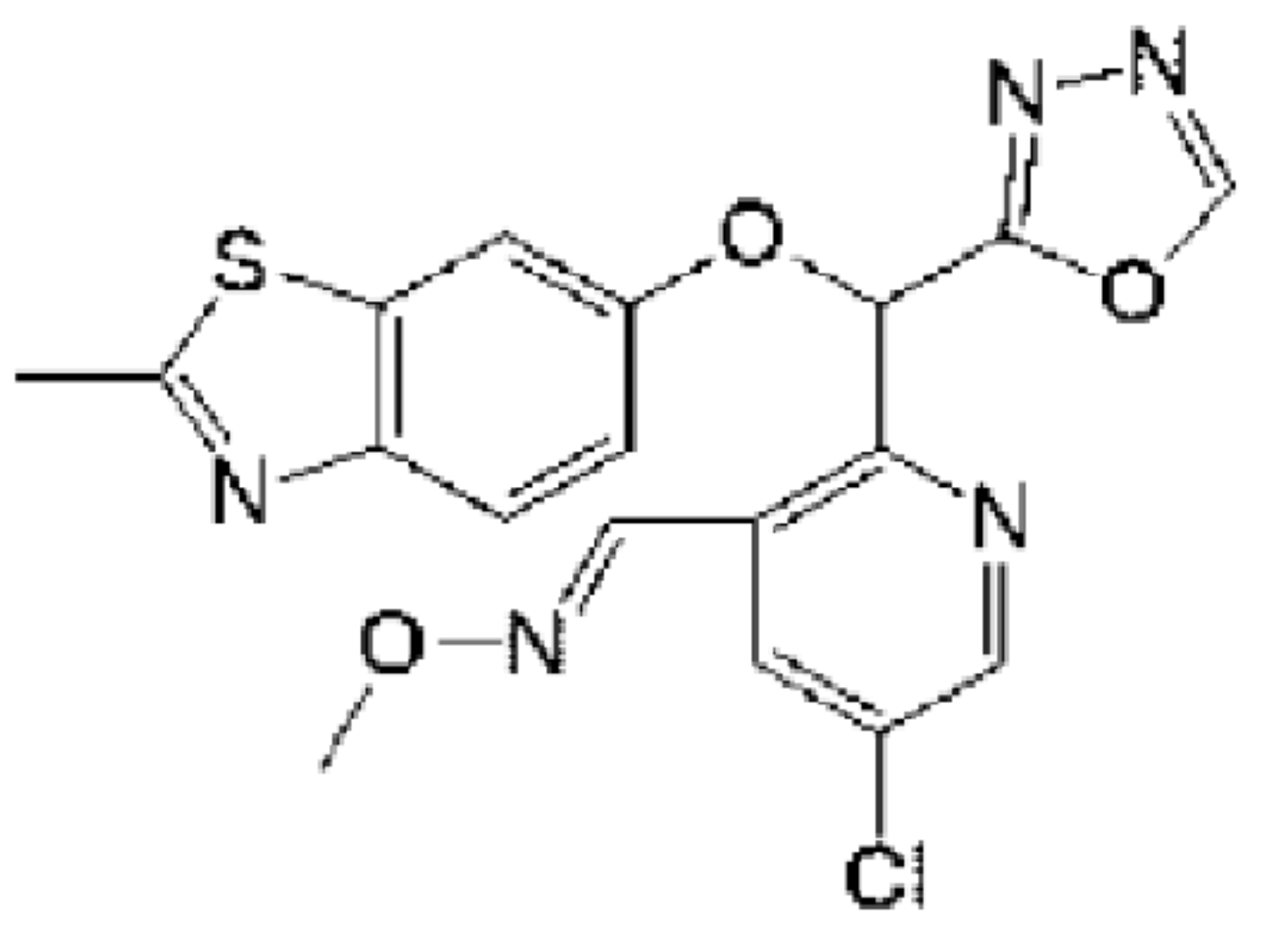
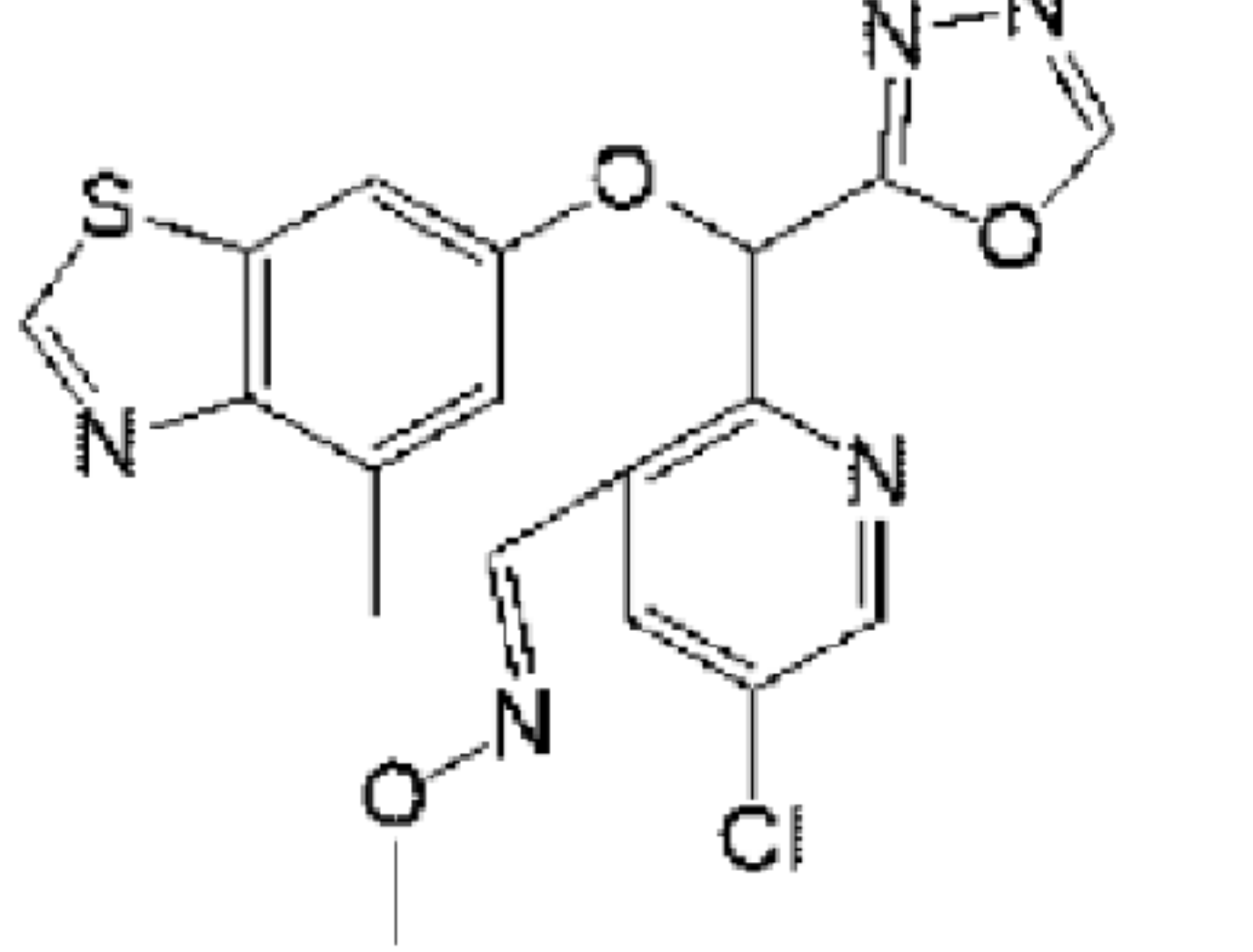
【0210】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-23		m.p. : 146-148°C
b-24		m.p. : 80-82°C
b-25		黏性油
b-26		m.p. : 118-121°C
b-27		m.p. : 129-131°C

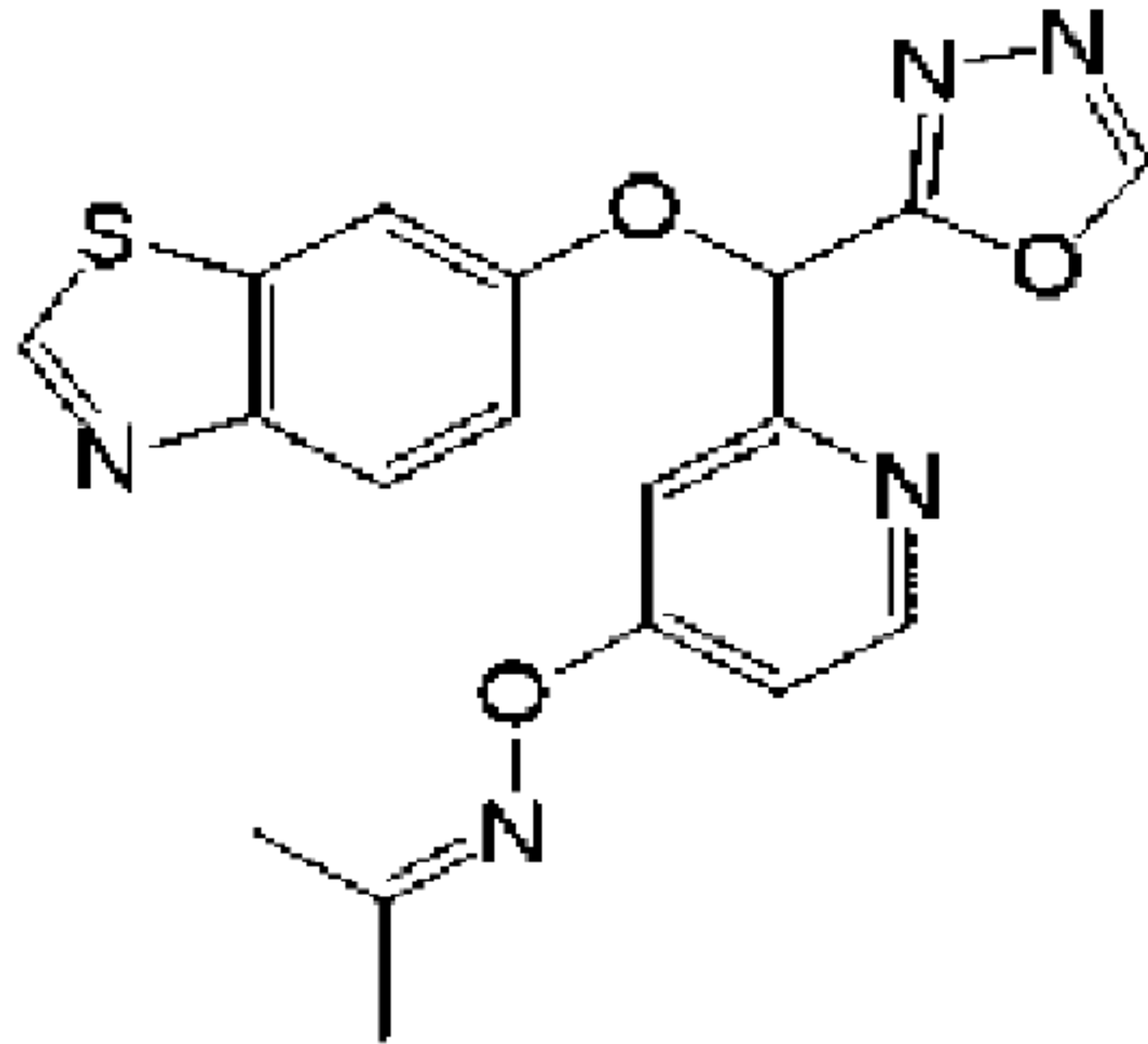
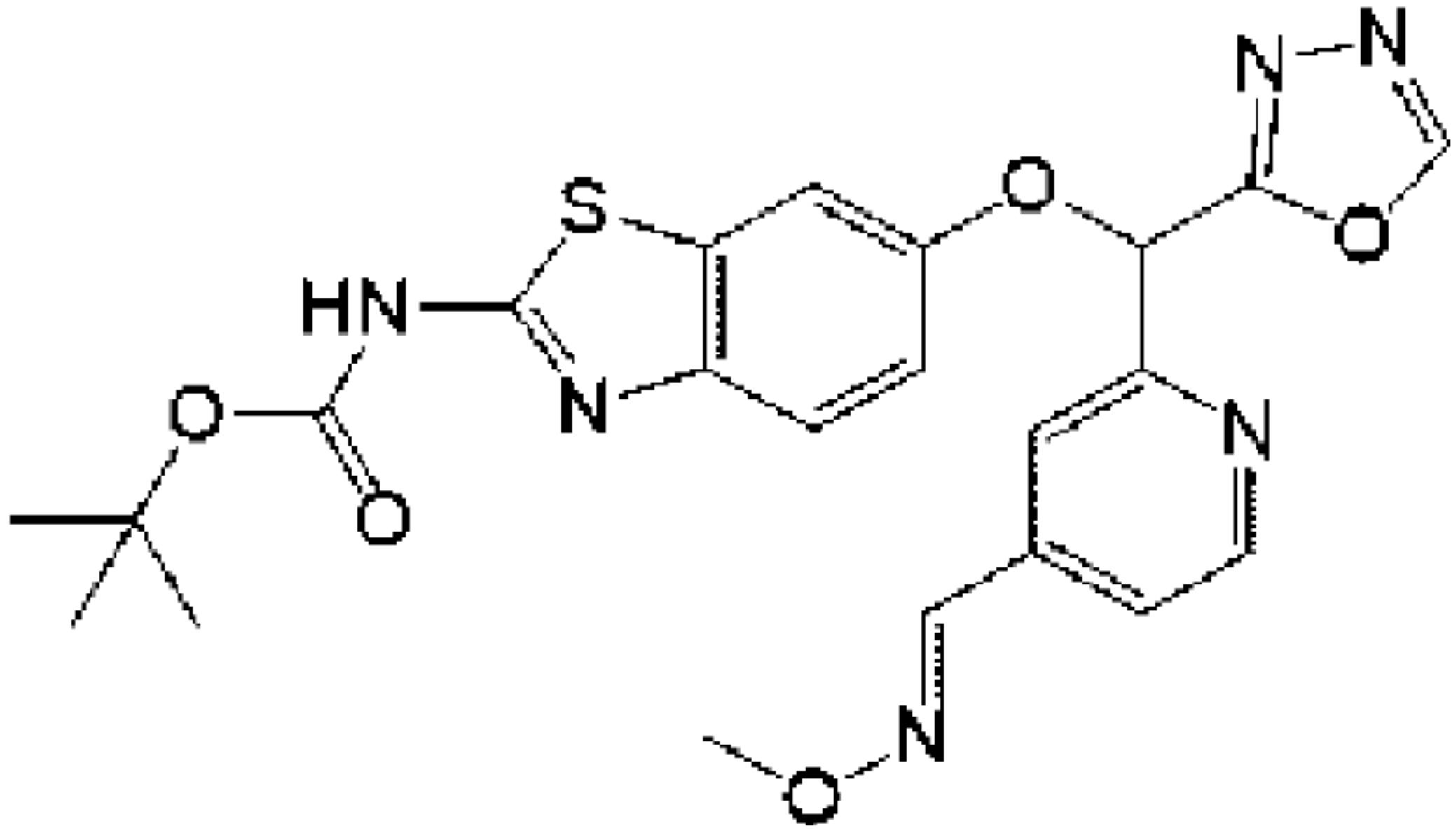
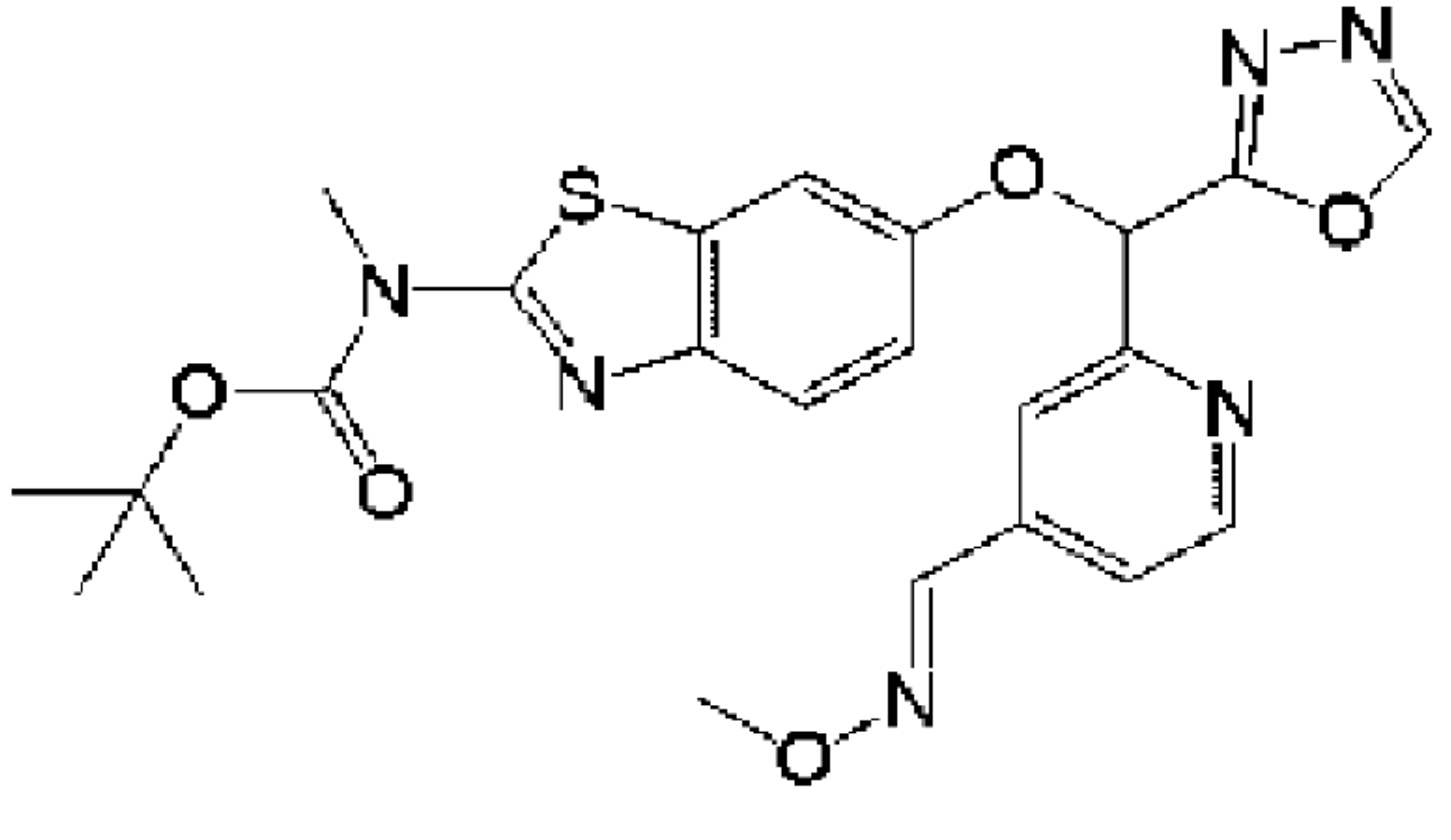
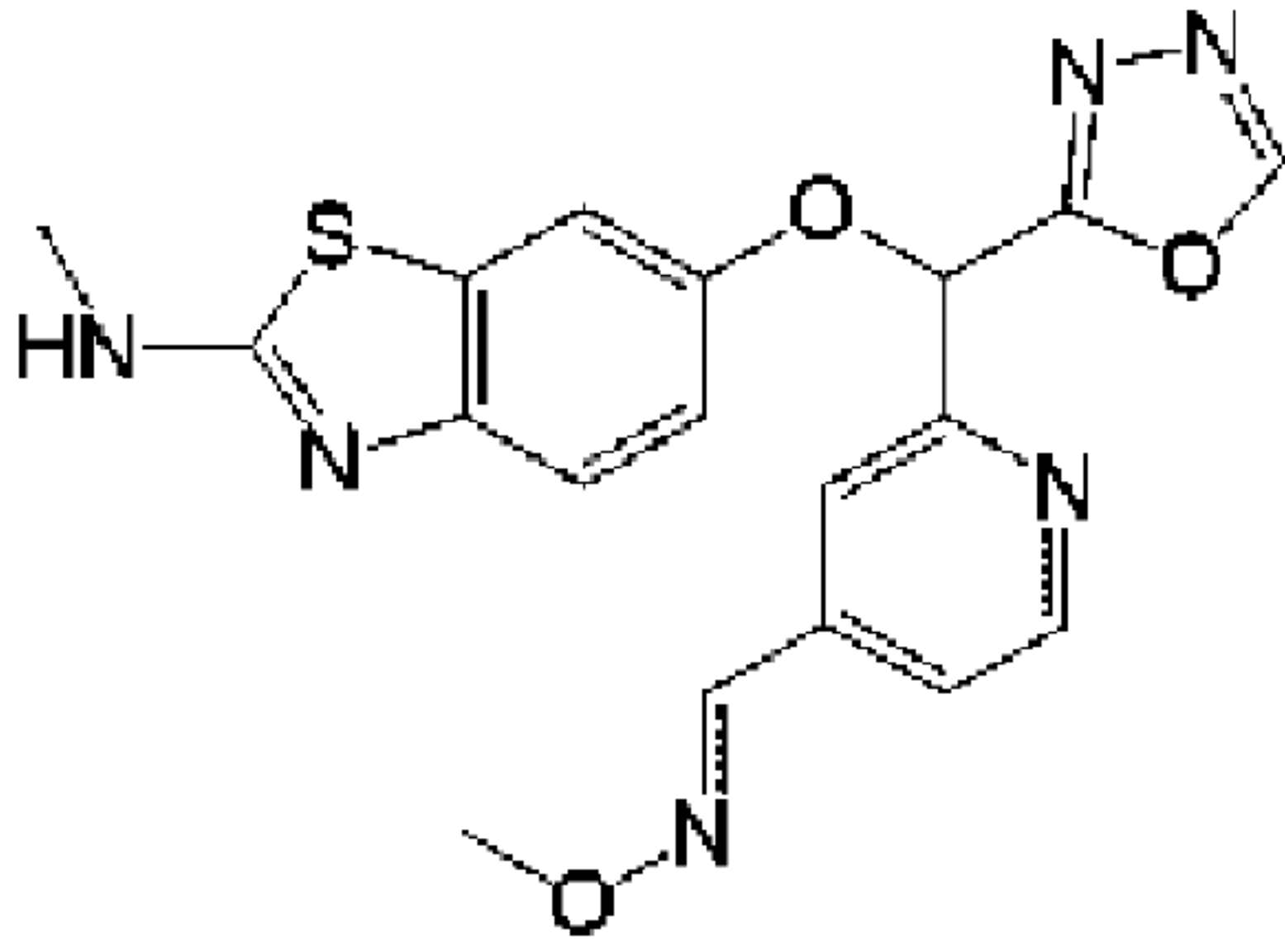
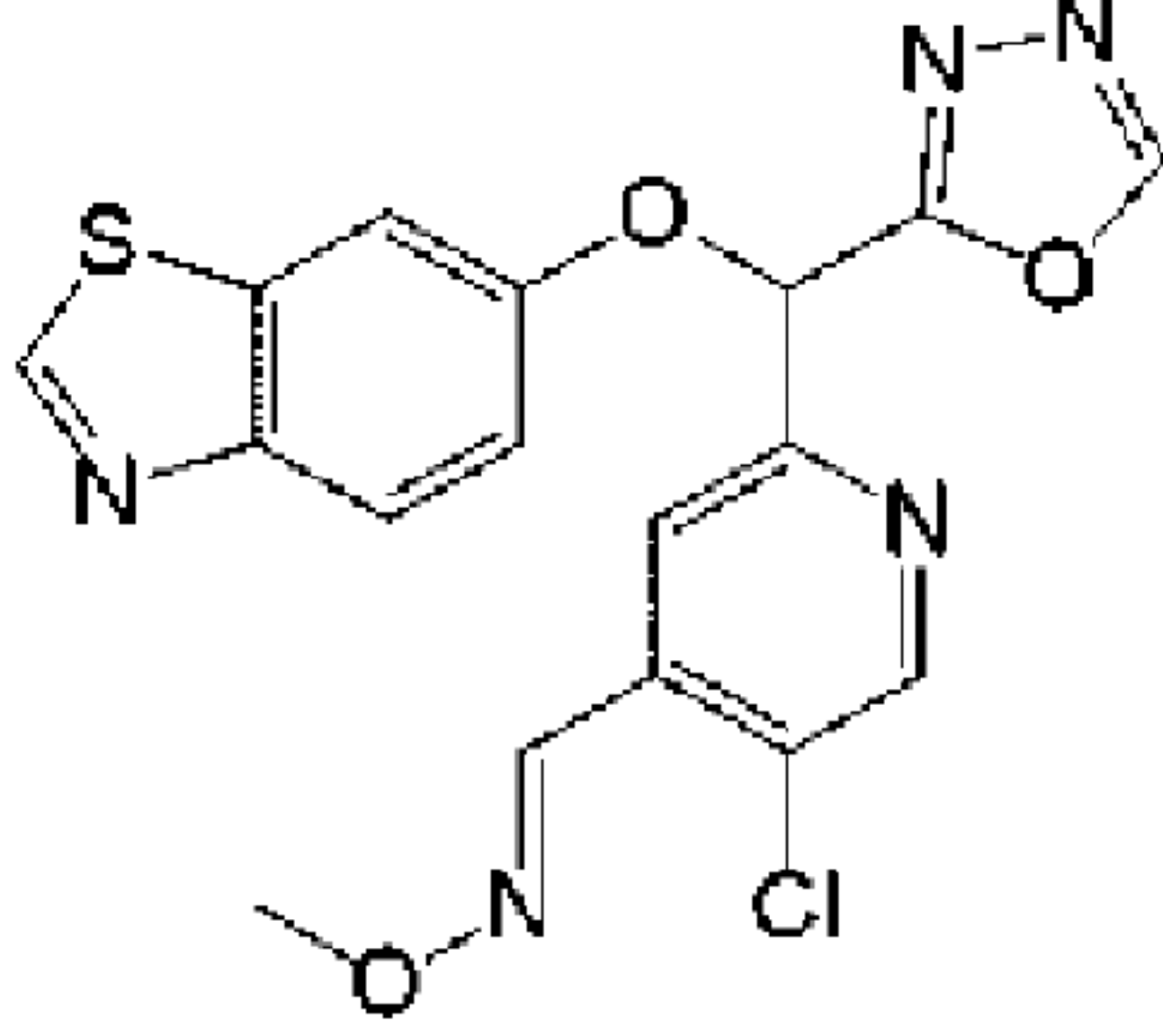
【0211】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-28		非晶形
b-29		黏性油
b-30		m.p. : 216-220℃
b-31		m.p. : 198-201℃
b-32		m.p. : 122-124℃

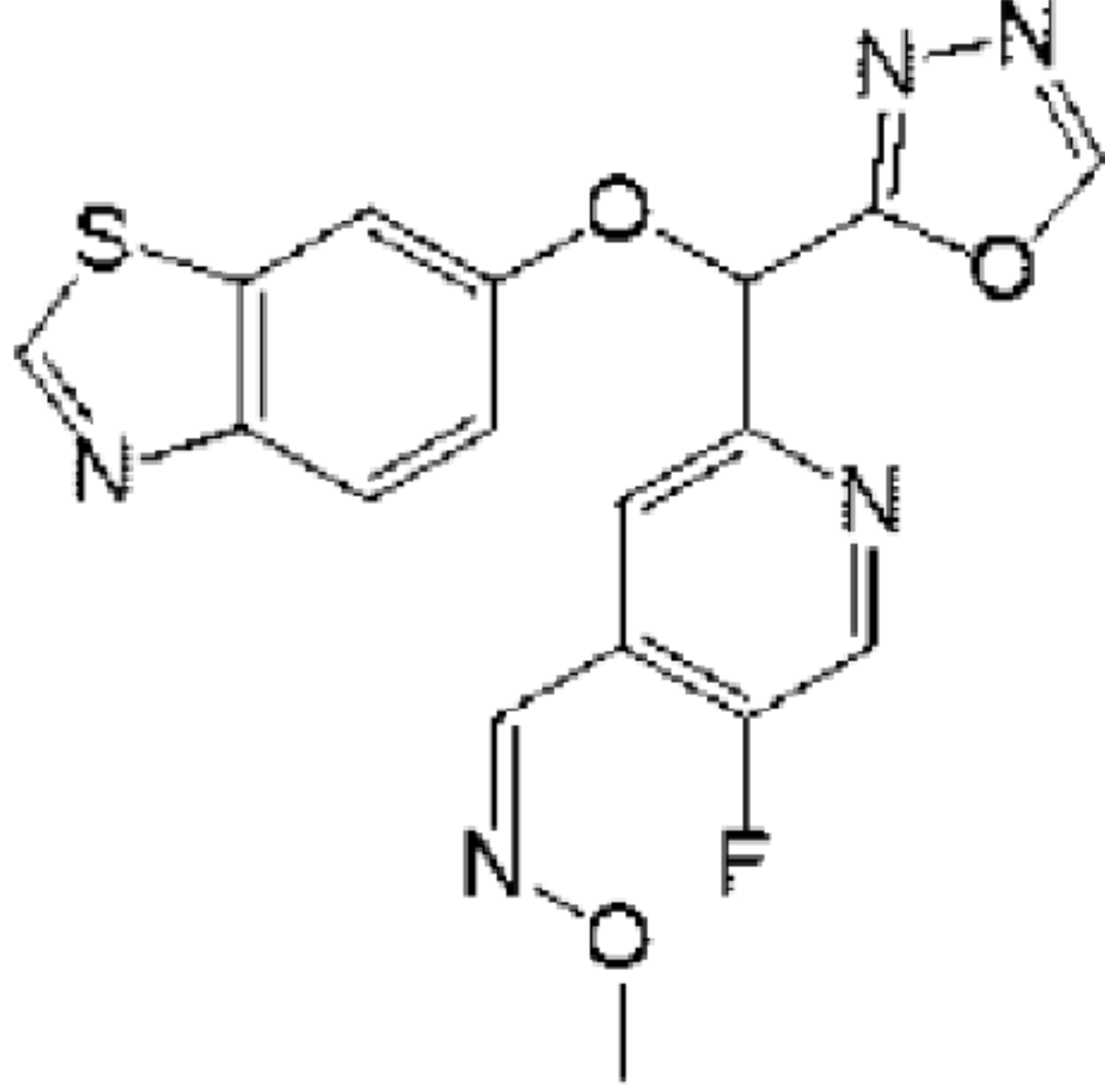
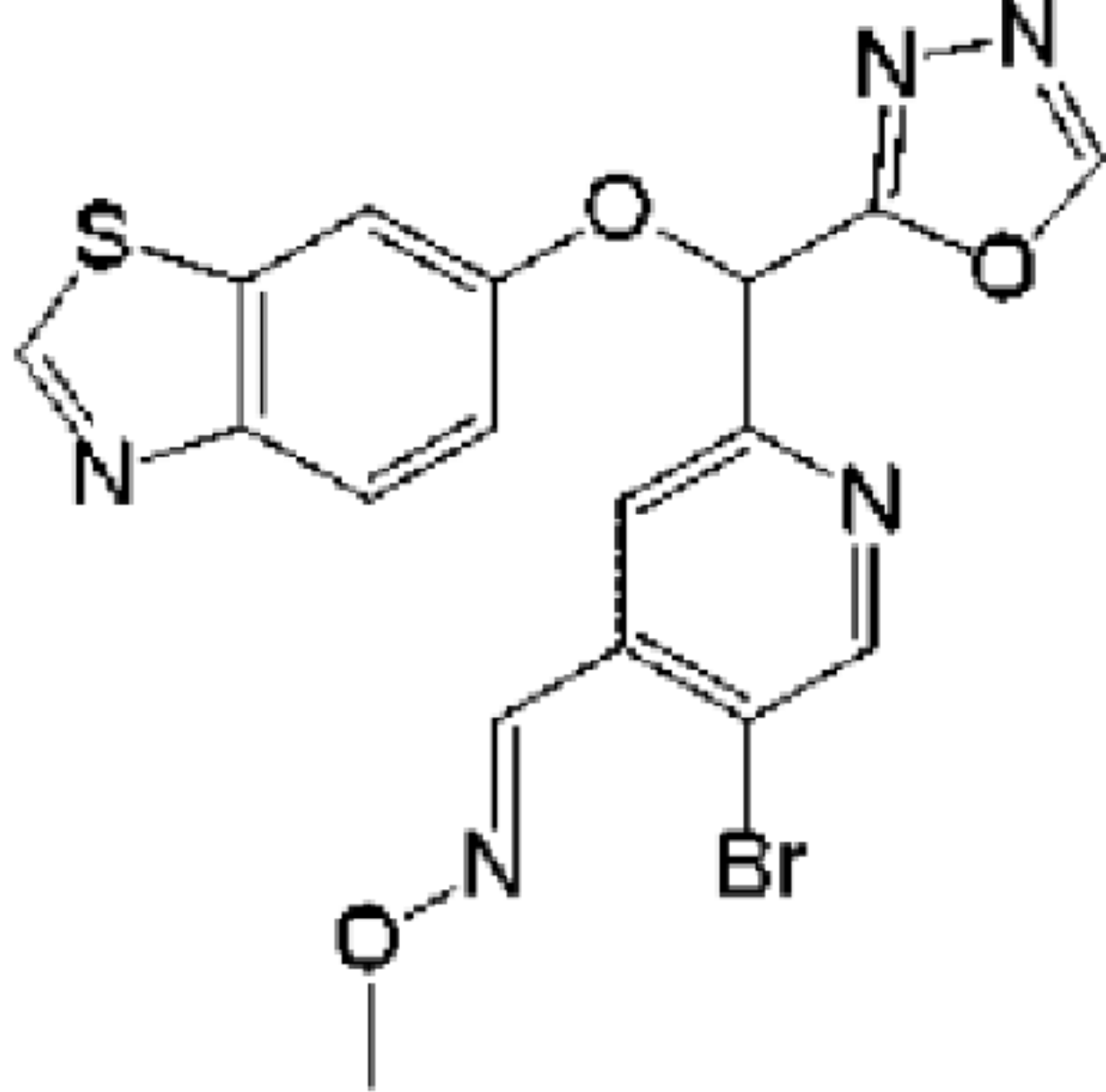
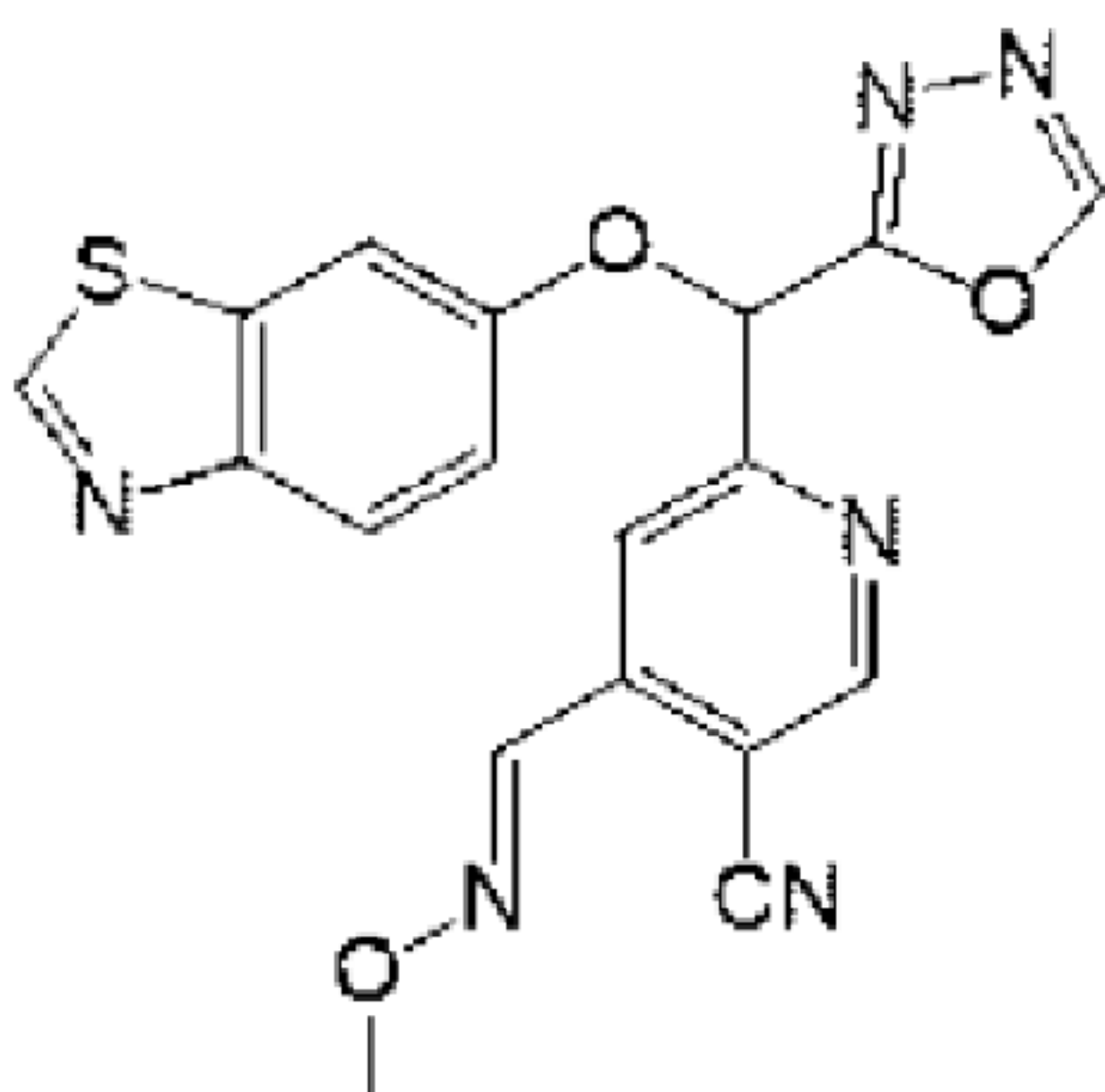
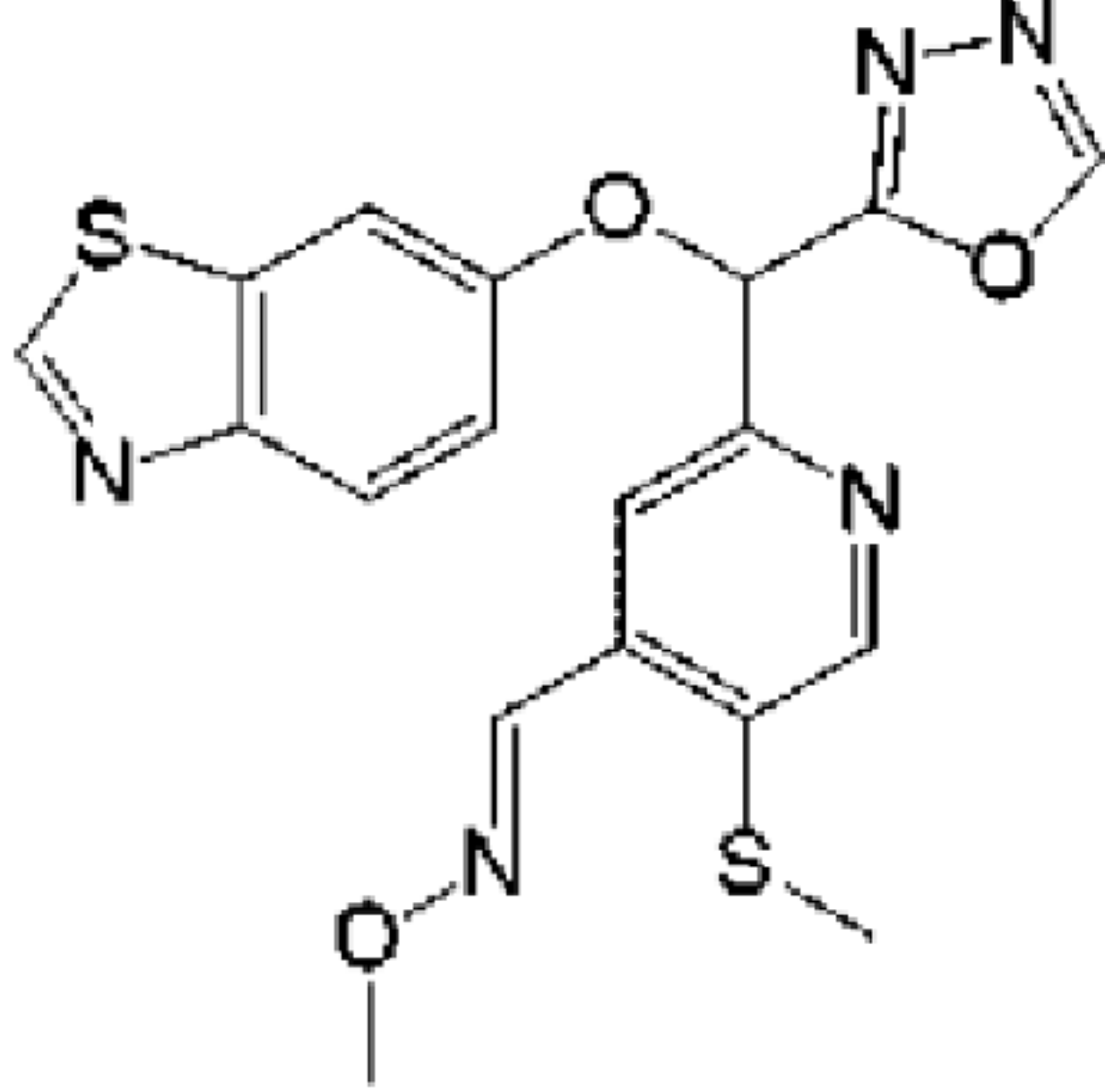
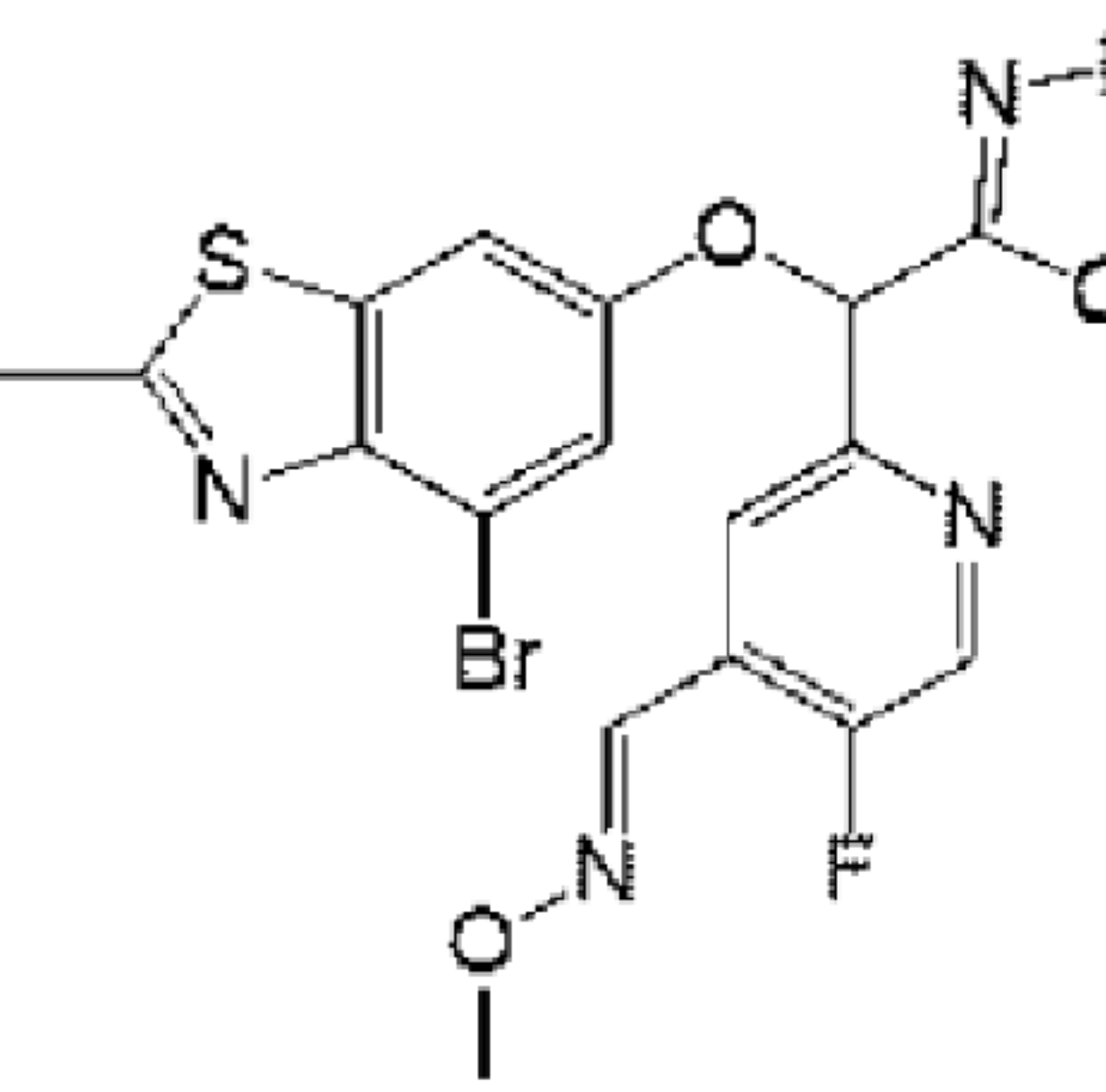
【0212】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-33		非晶形
b-34		黏性油
b-35		黏性油
b-36		黏性油
b-37		非晶形

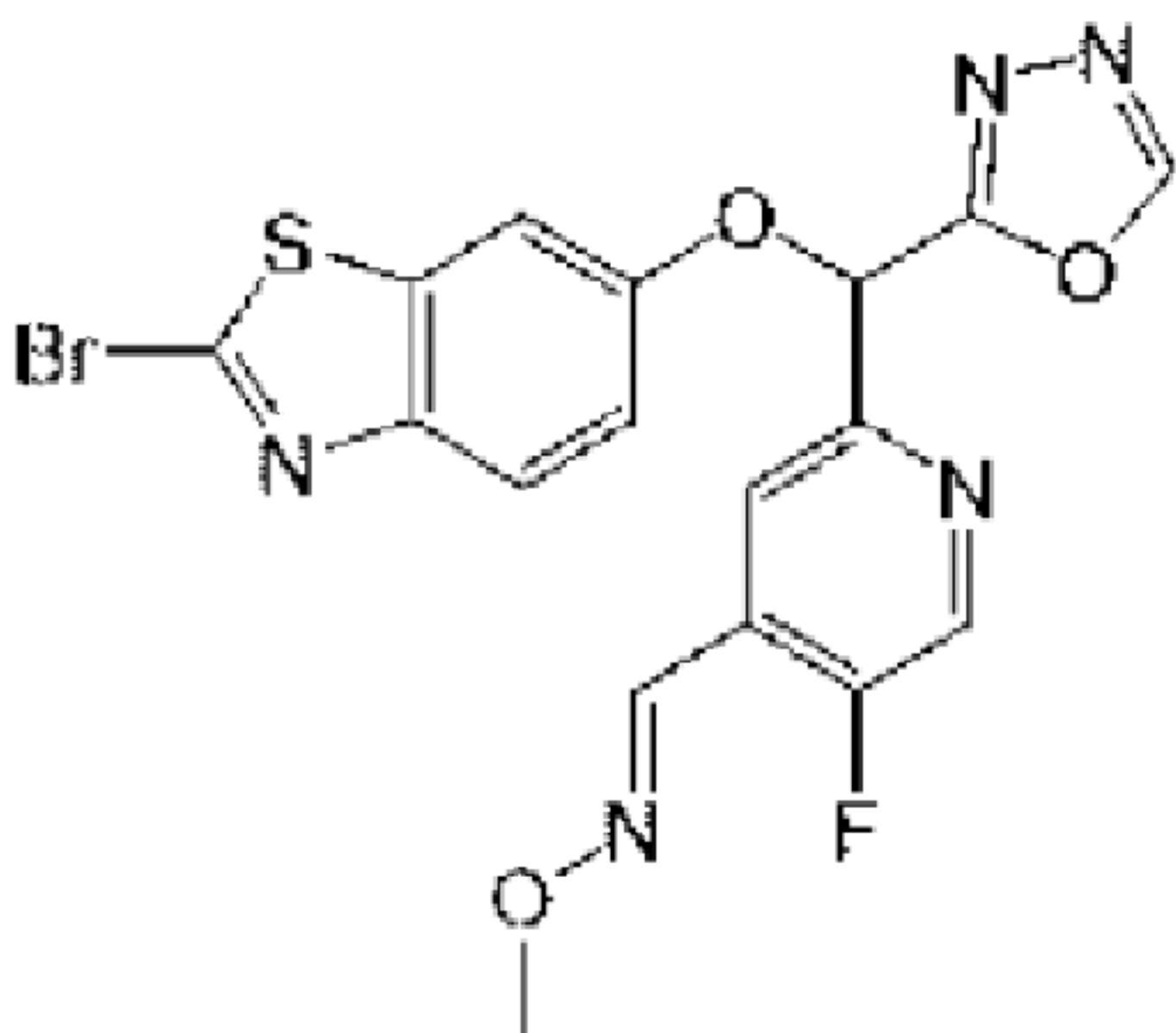
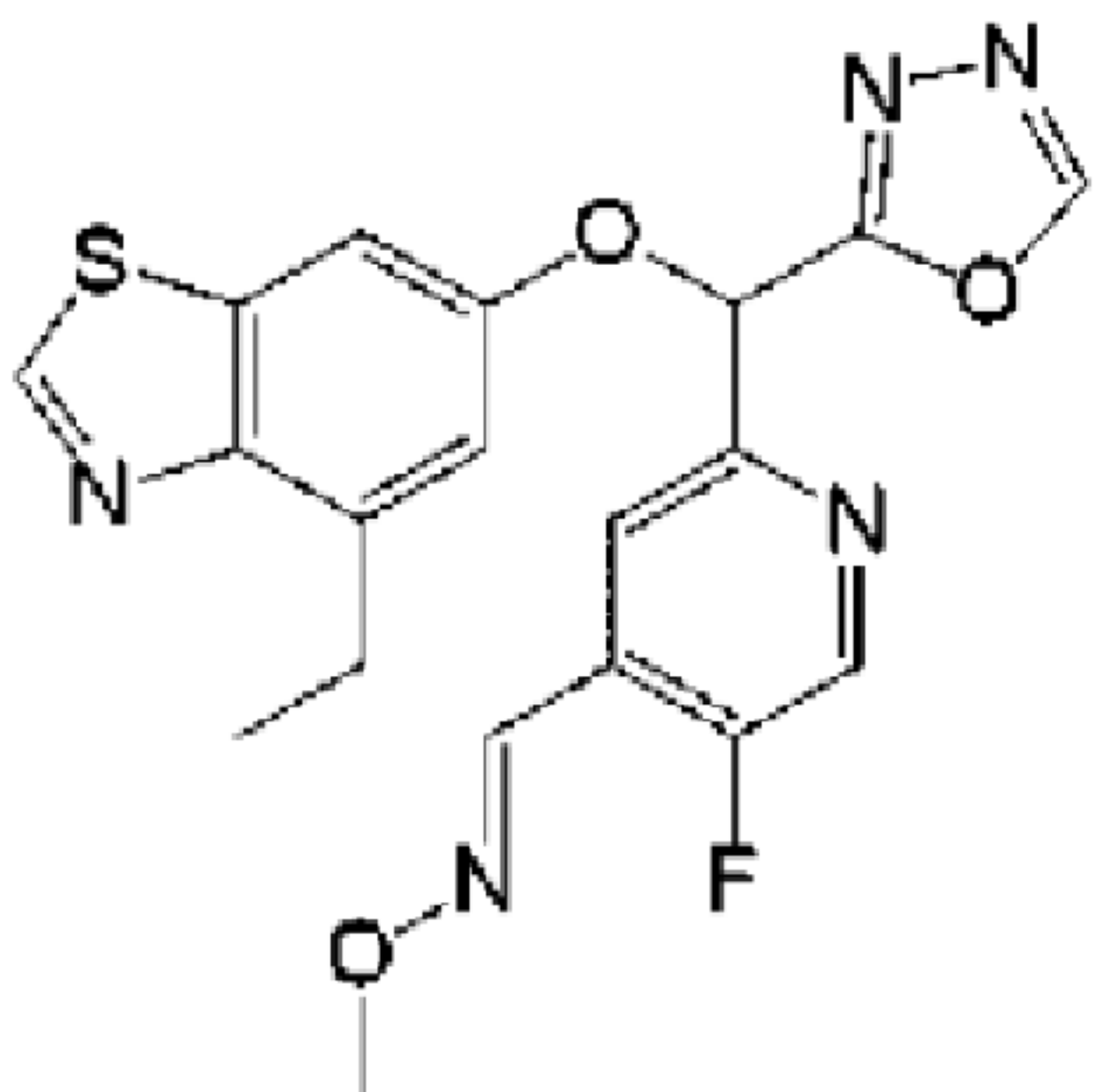
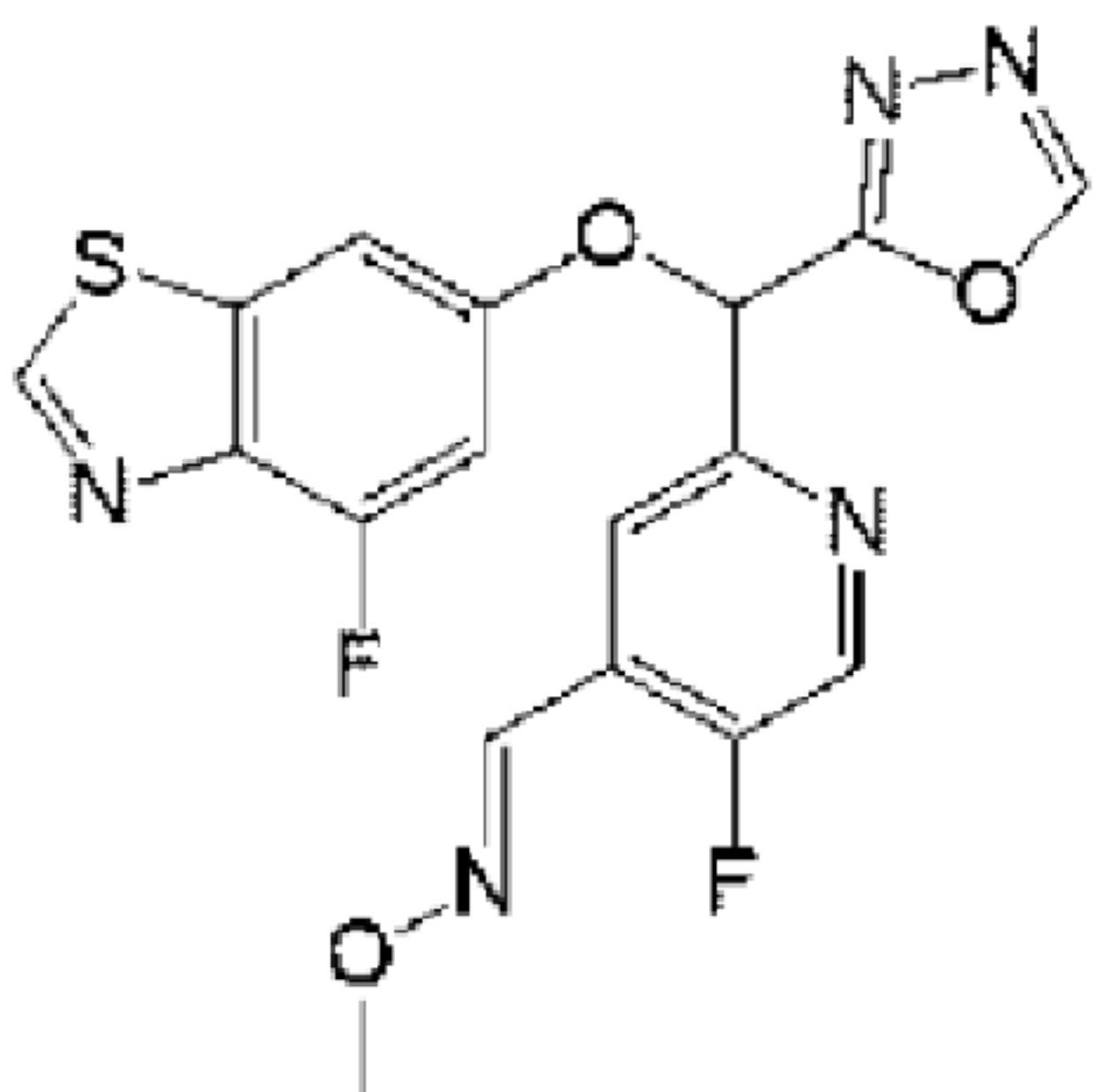
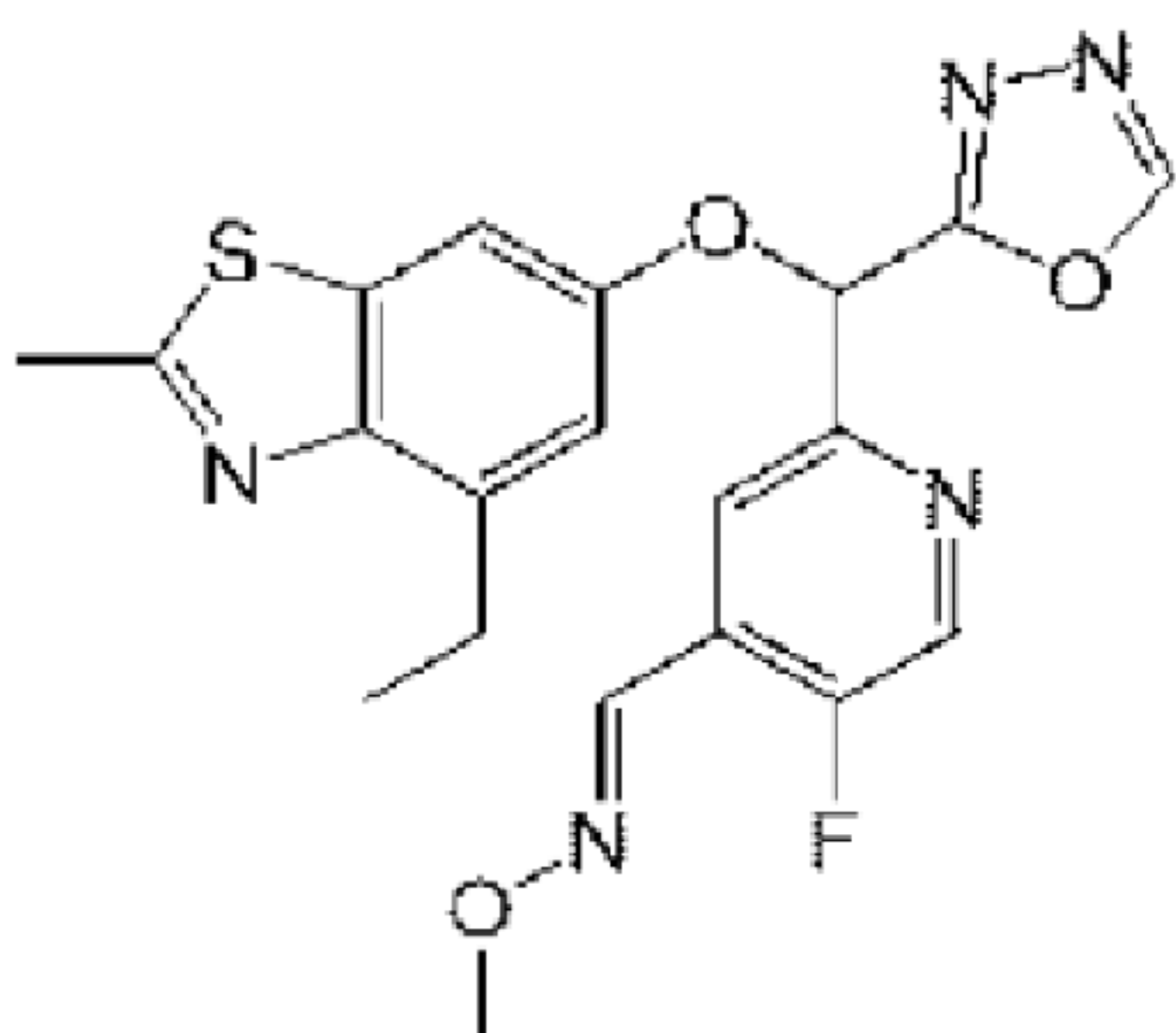
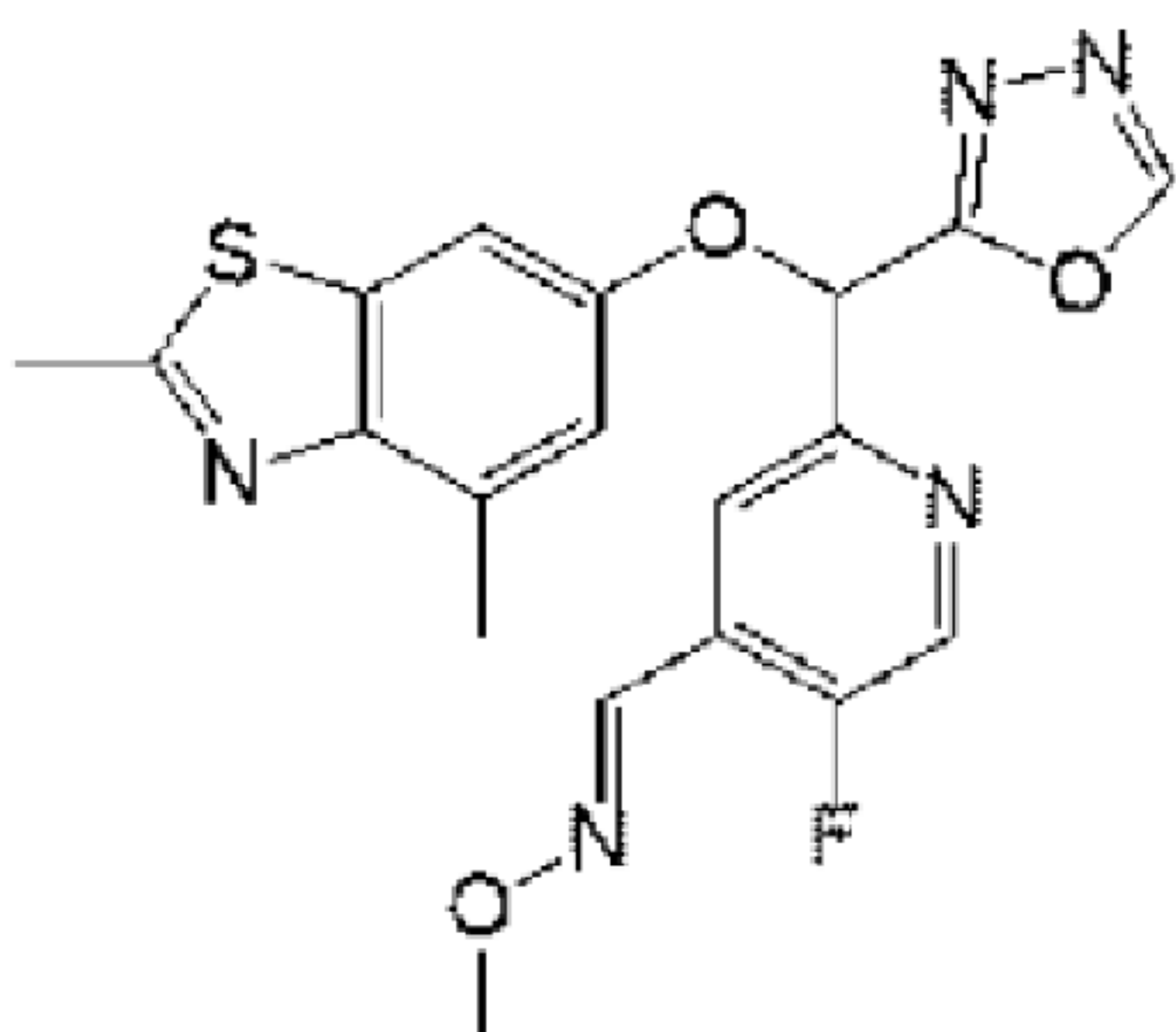
【0213】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-38		非晶形
b-39		n _D (20.5°C) 1.6144
b-40		m.p. : 129-131°C
b-41		黏性油
b-42		m.p. : 70-75°C

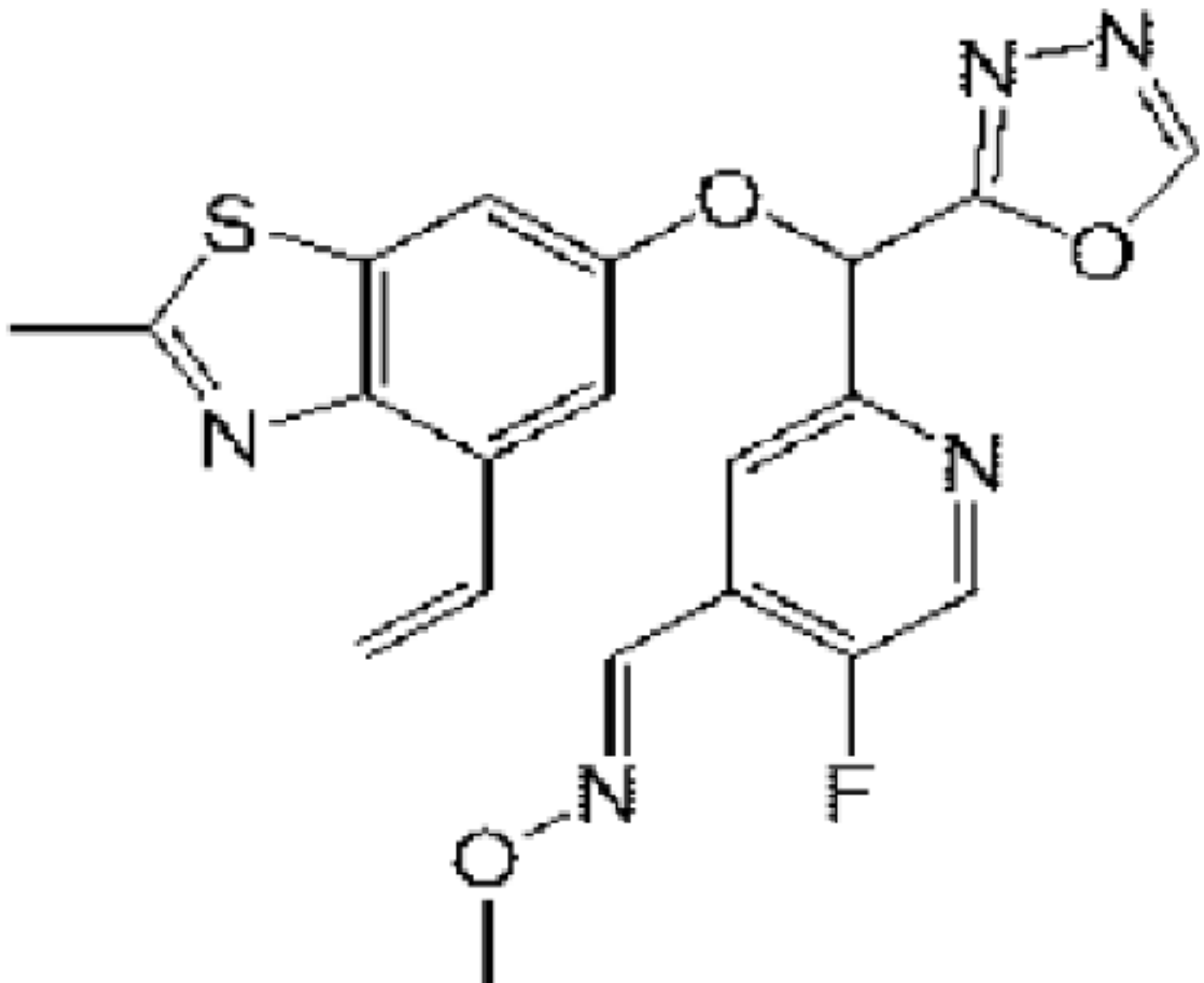
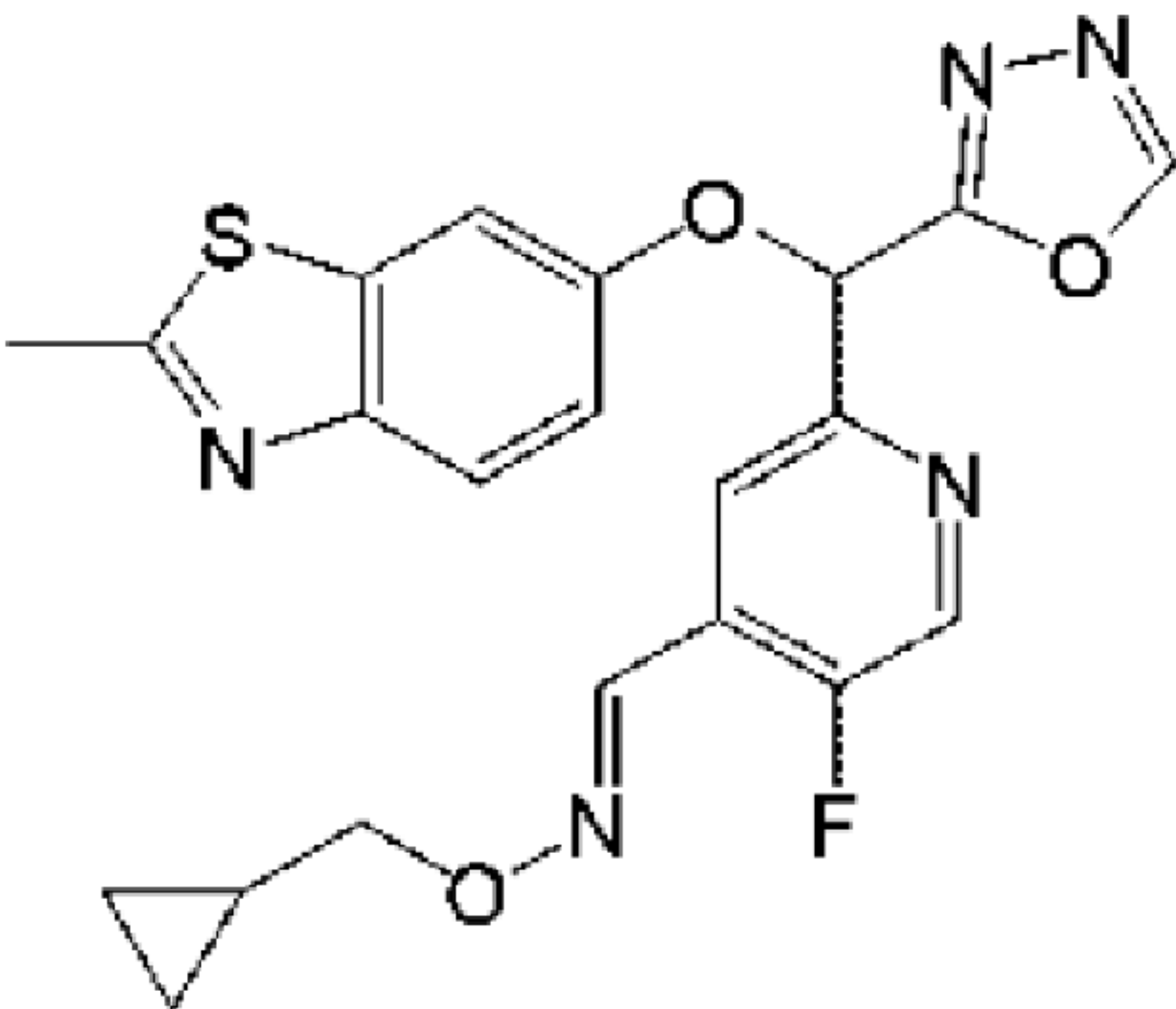
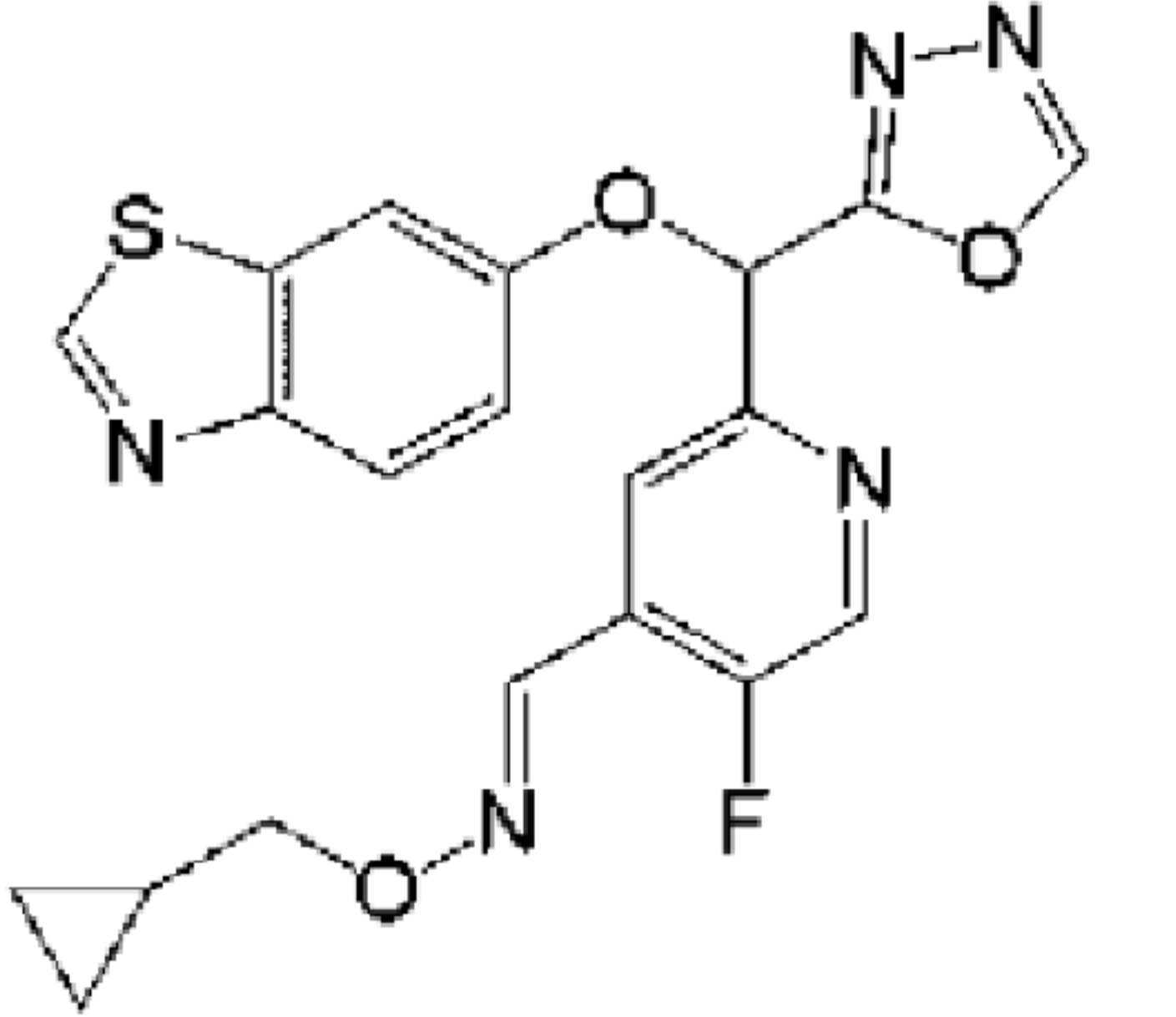
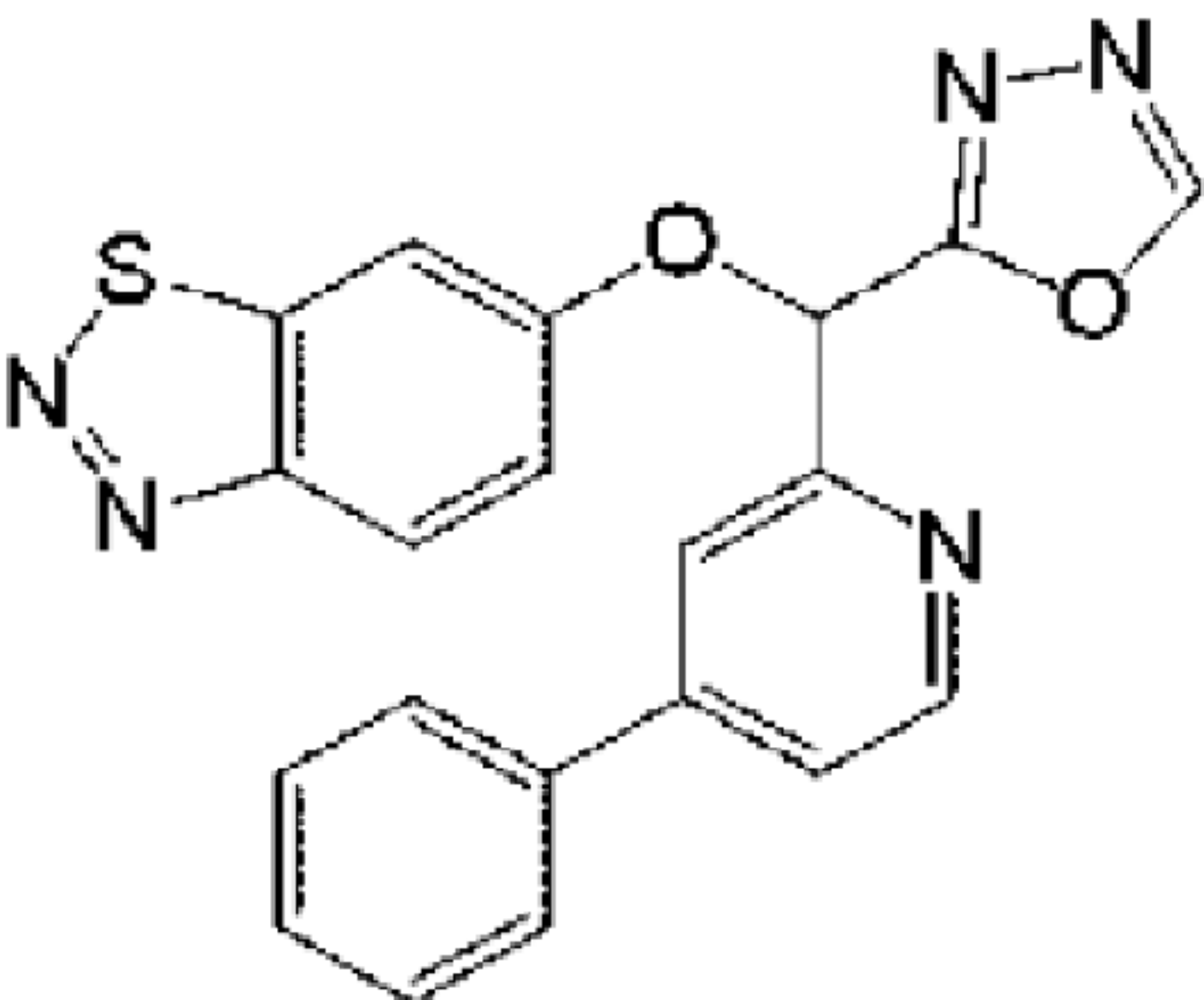
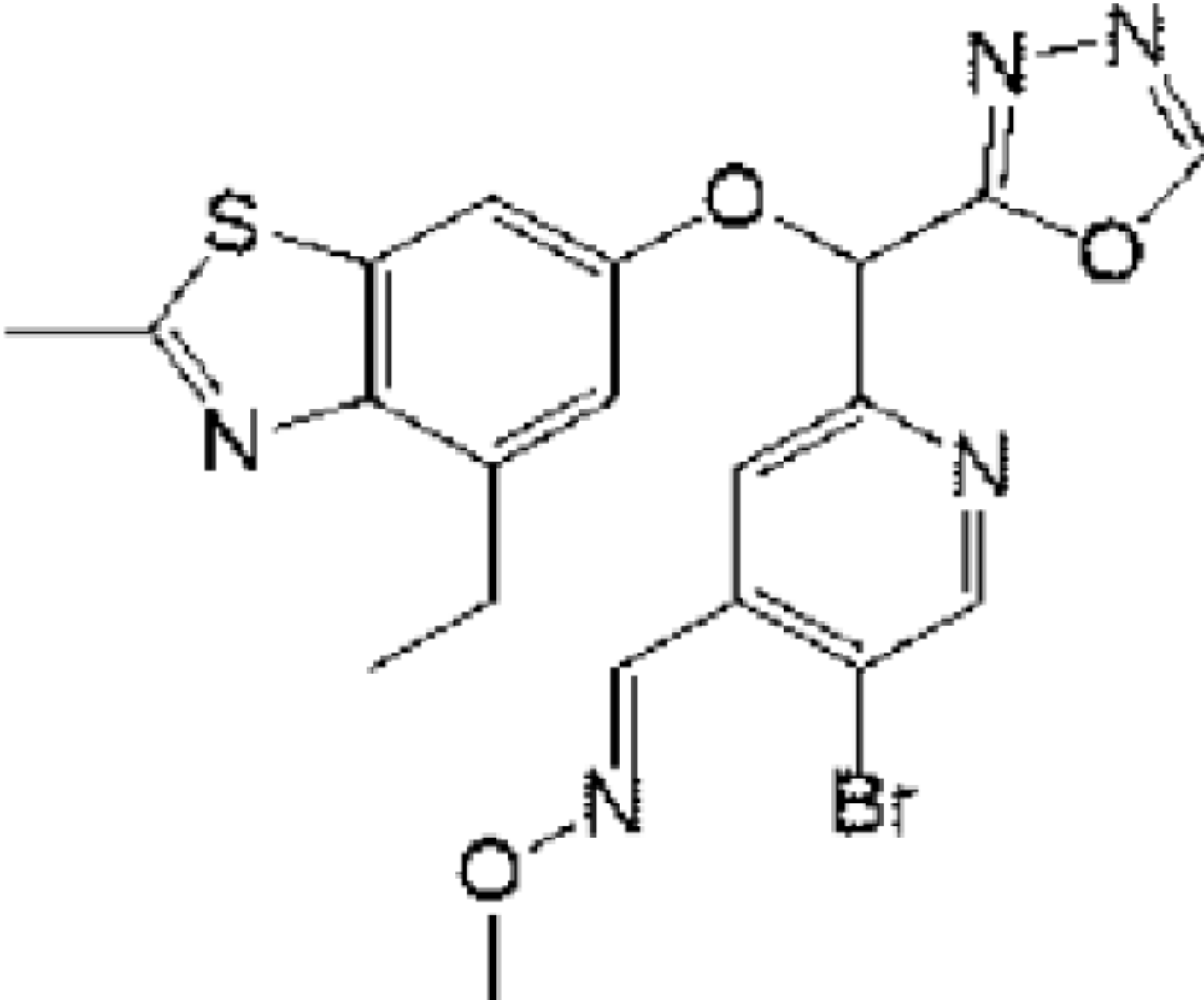
【0214】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-43		m.p. : 151-154°C
b-44		m.p. : 114-117°C
b-45		m.p. : 137-139°C
b-46		m.p. : 145-147°C
b-47		m.p. : 151-154°C

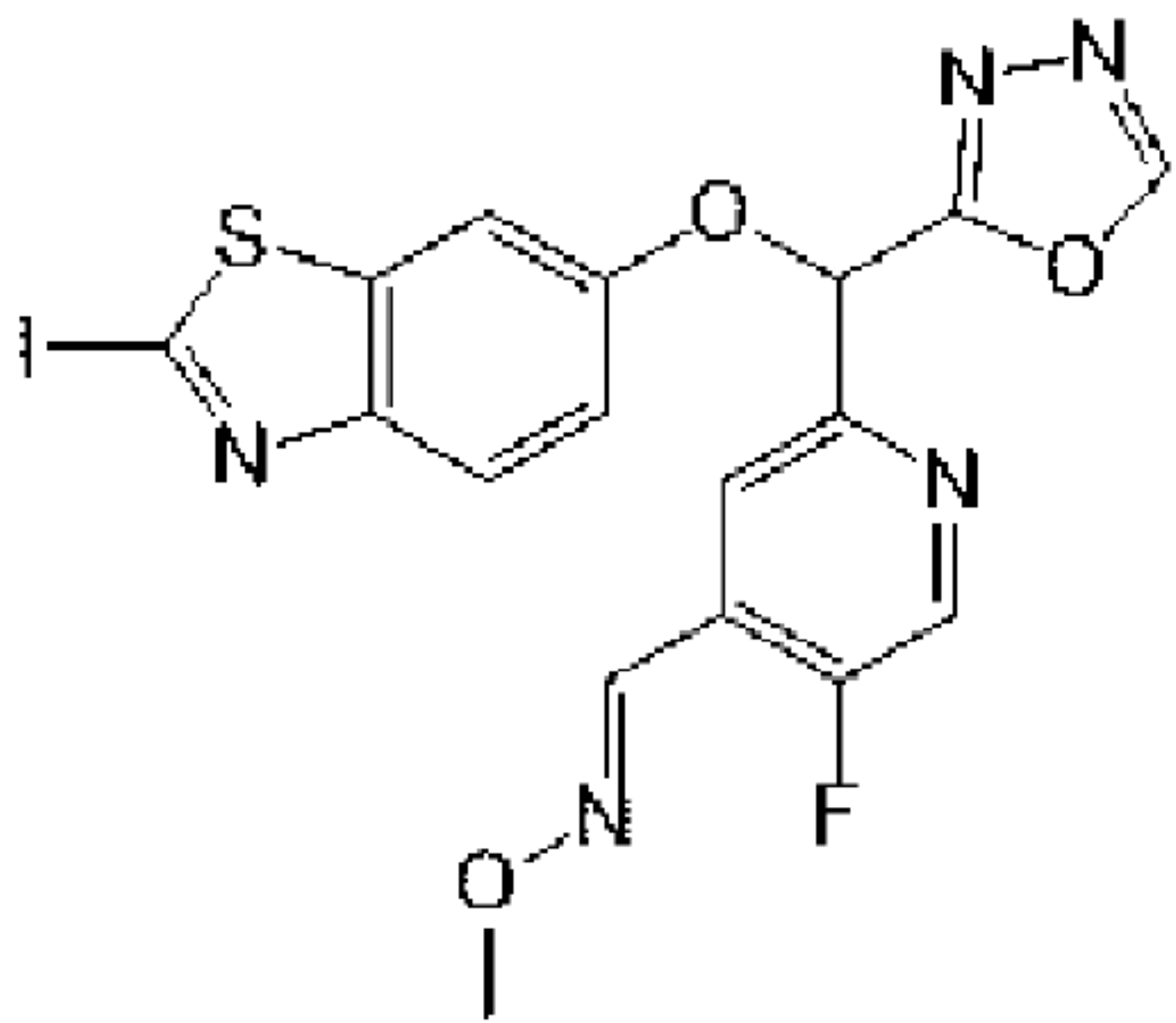
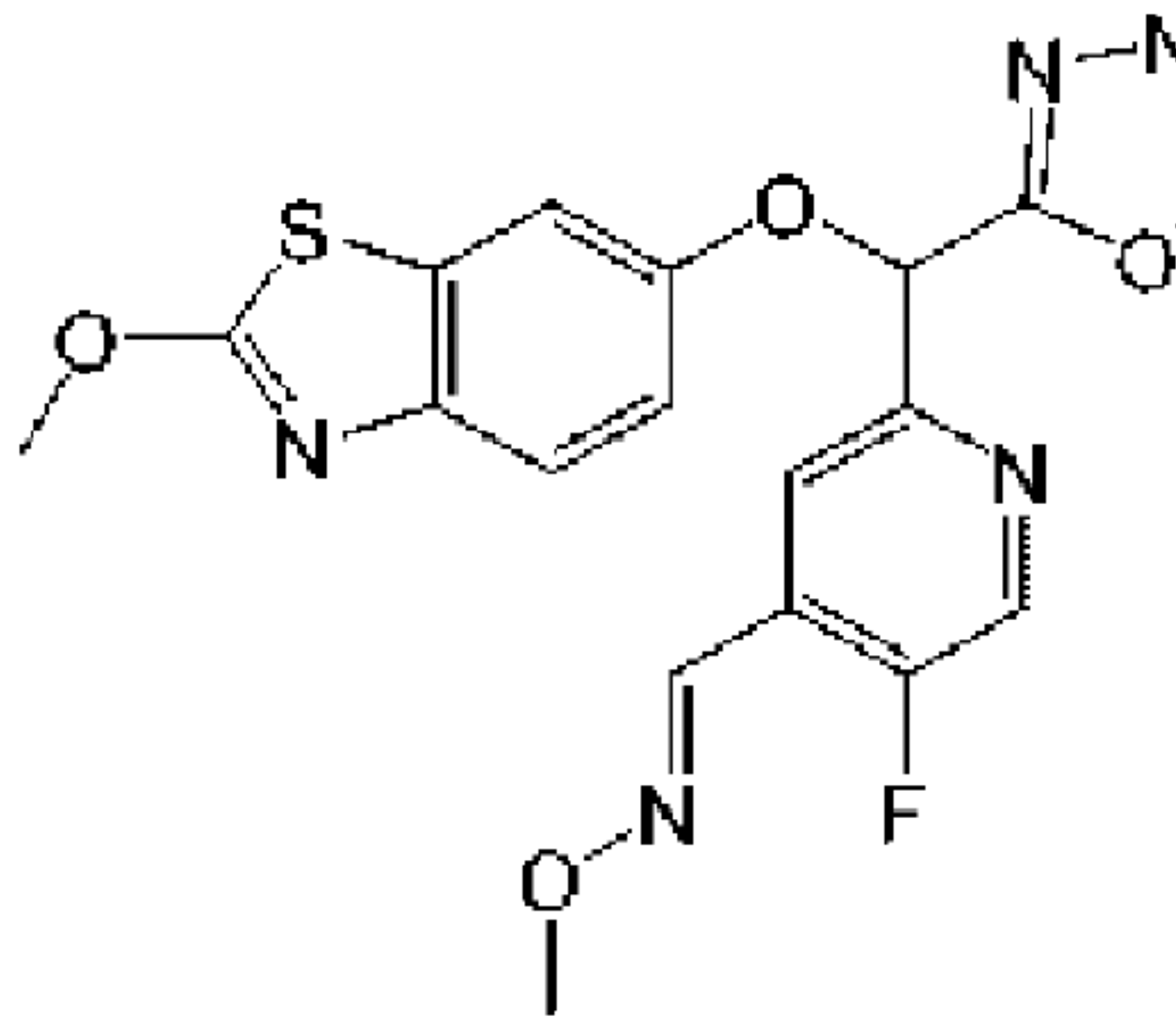
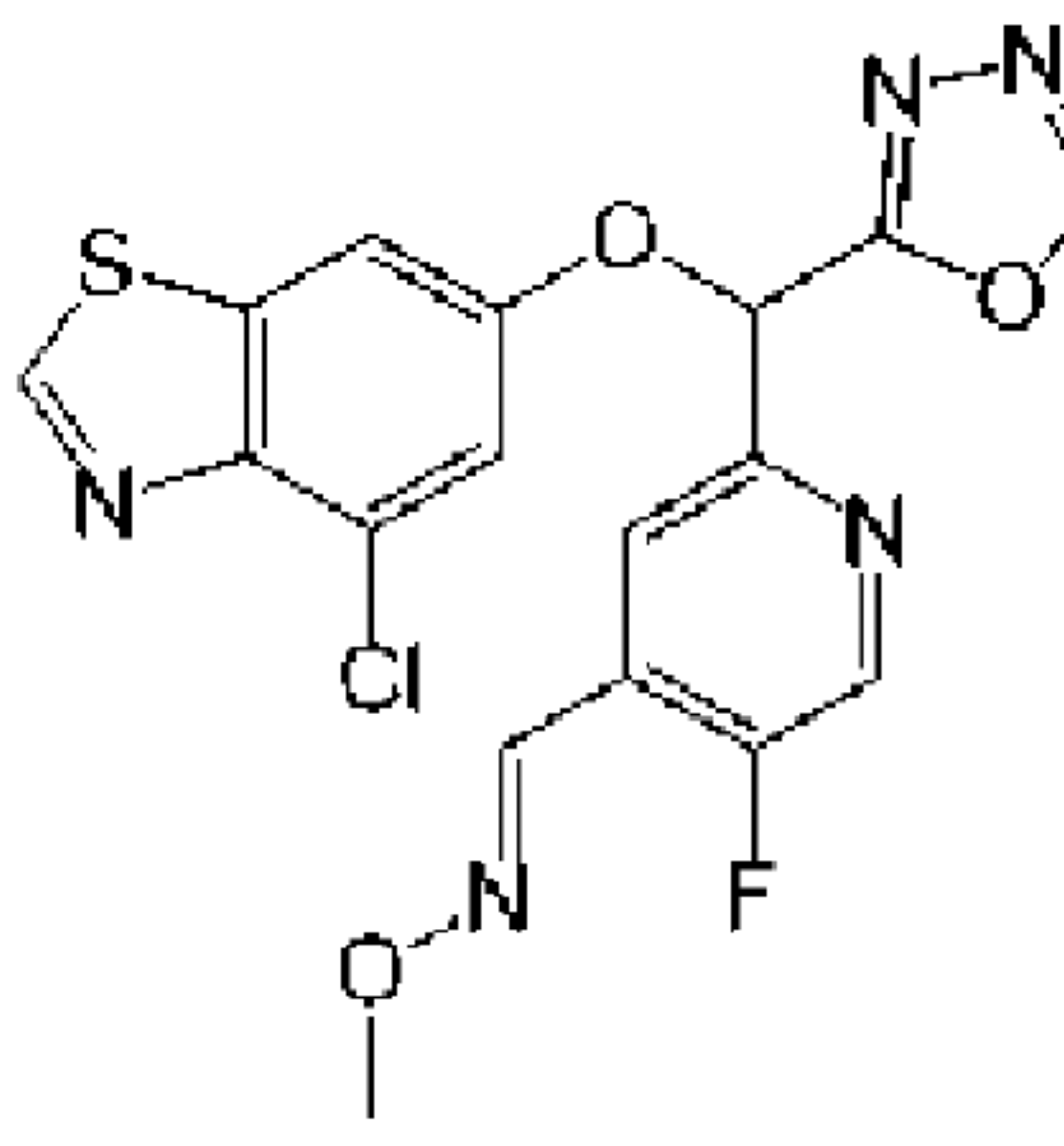
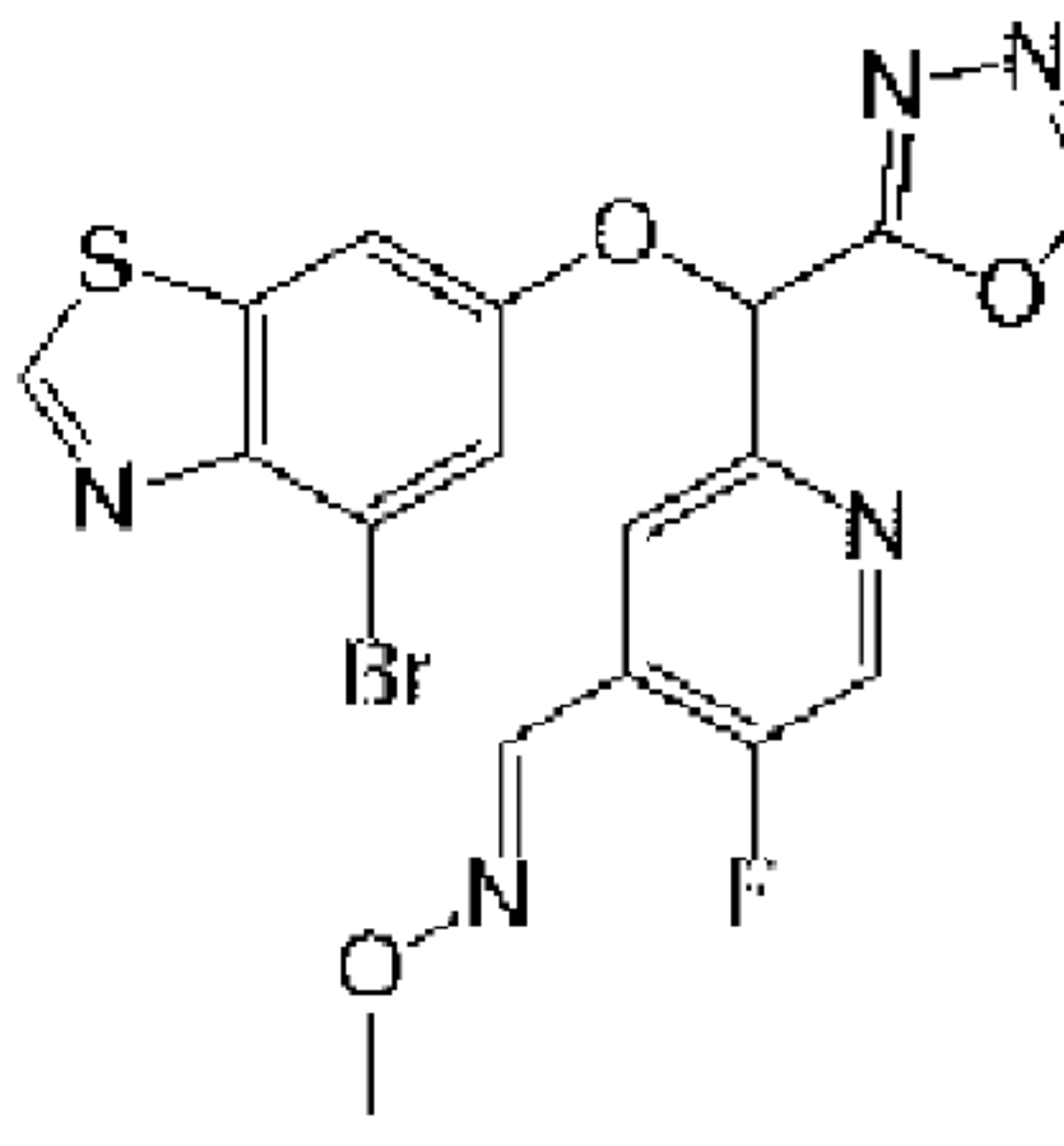
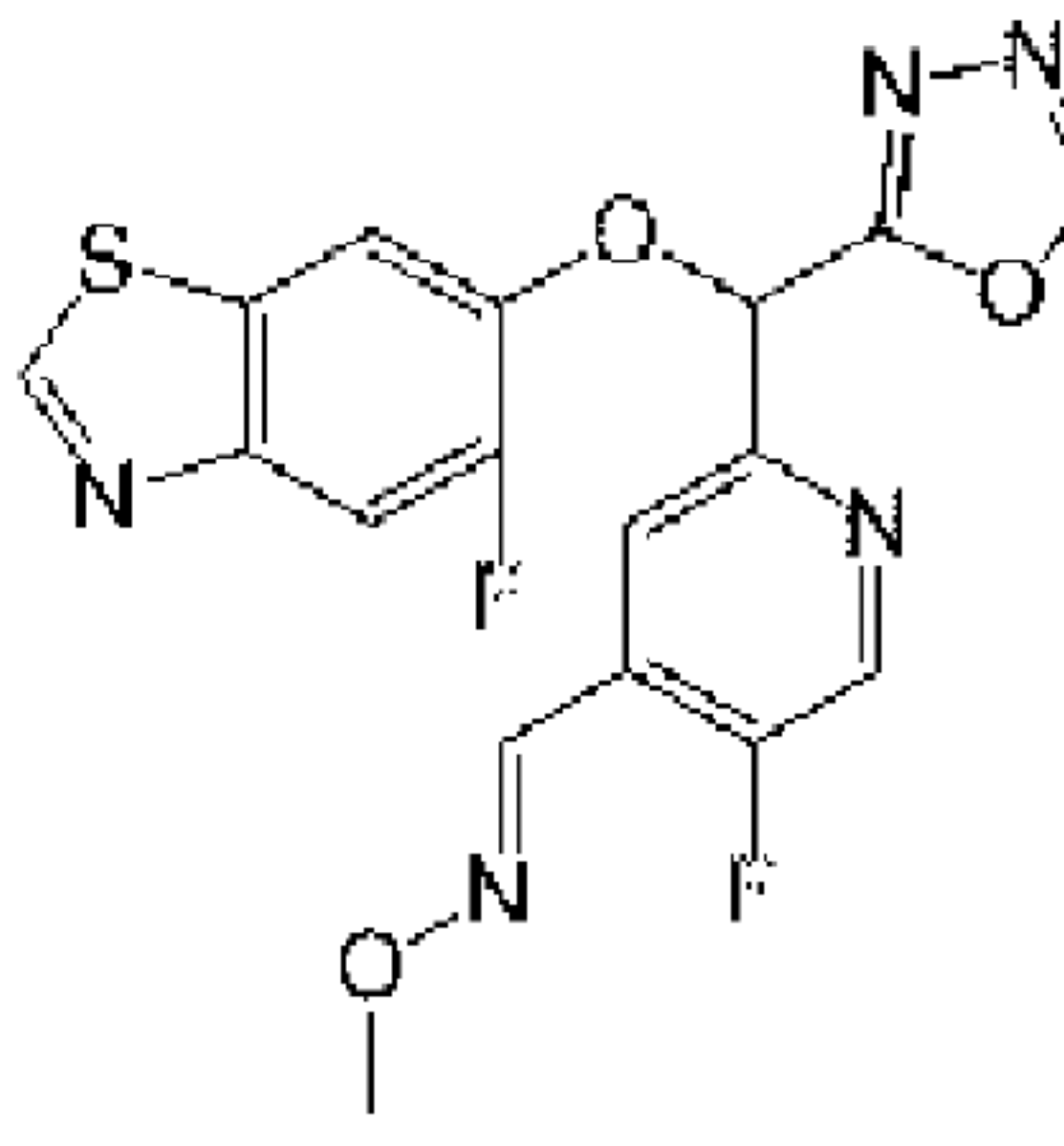
【0215】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-48		m.p. : 116-119°C
b-49		黏性油
b-50		m.p. : 129-131°C
b-51		非晶形
b-52		m.p. : 160-161°C

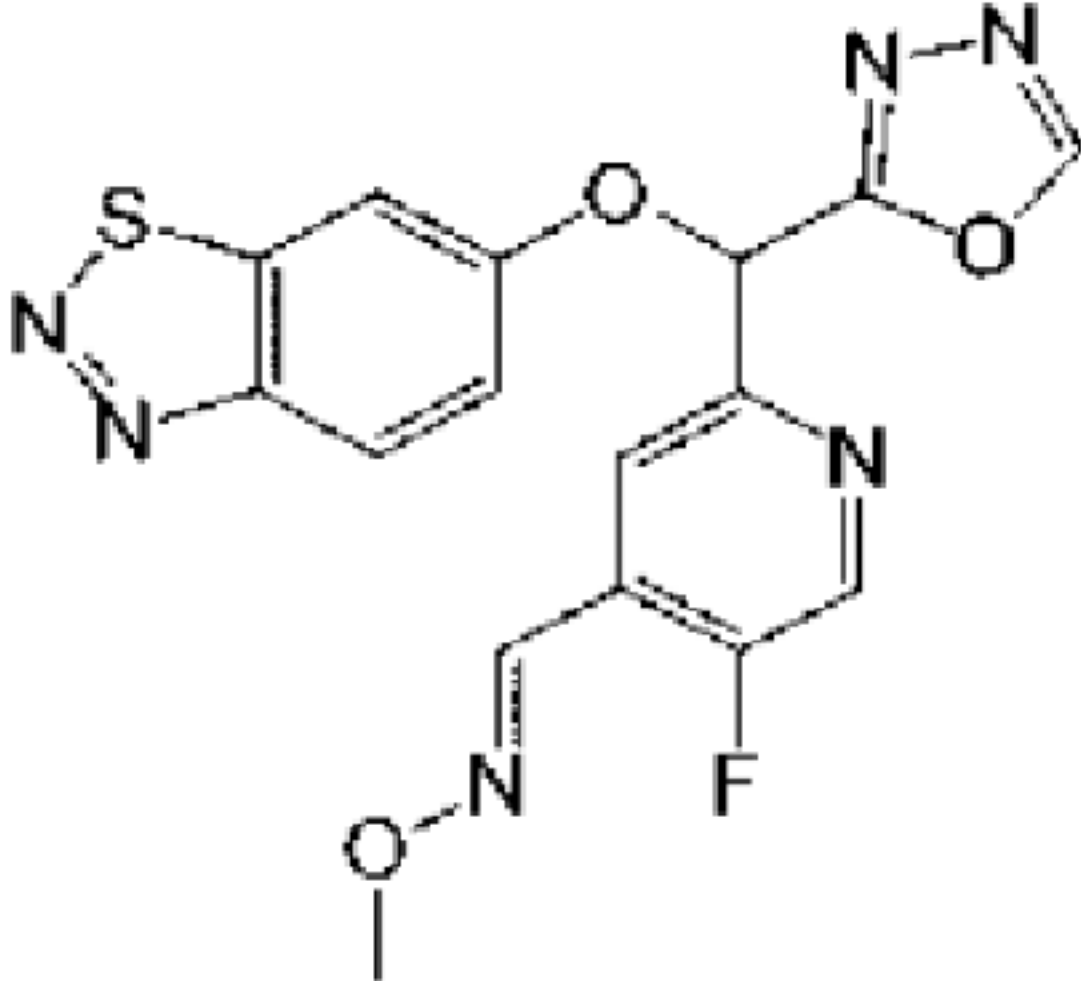
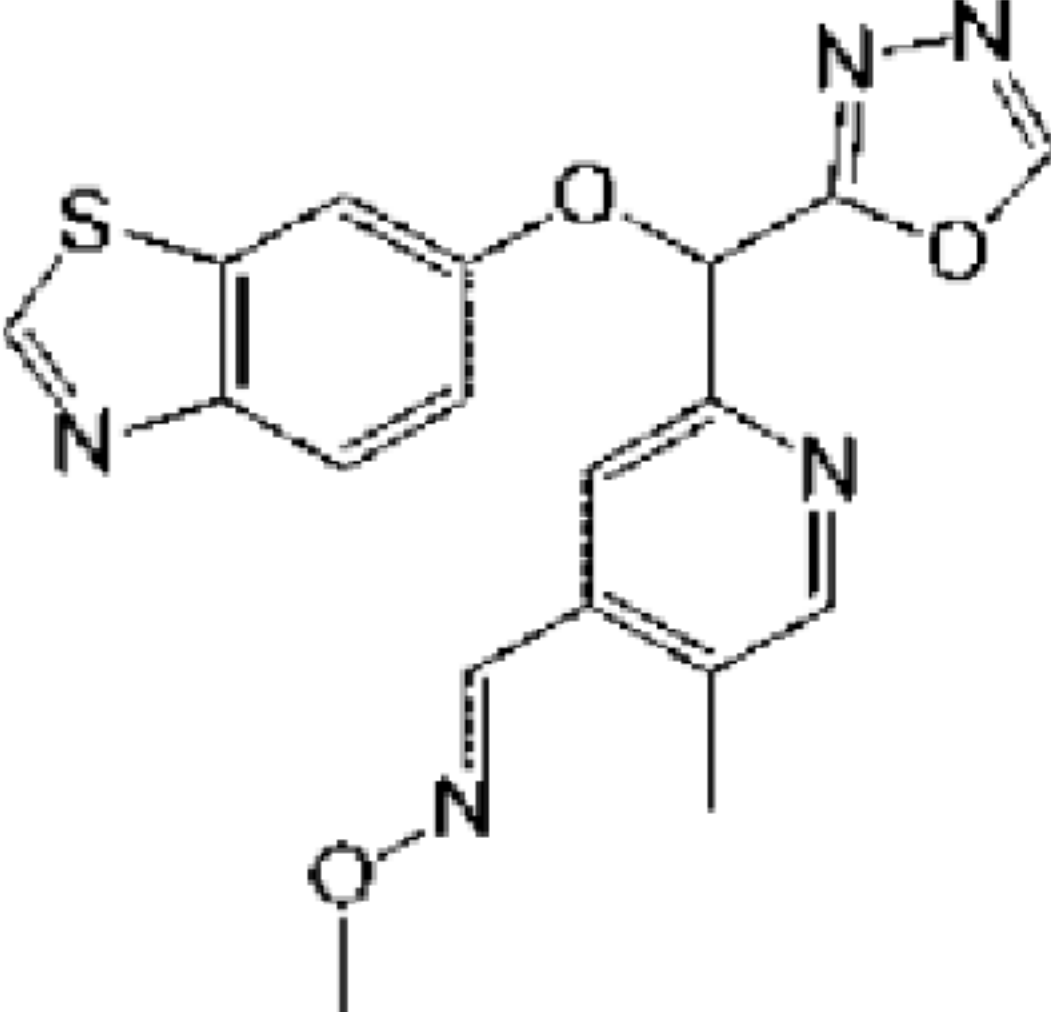
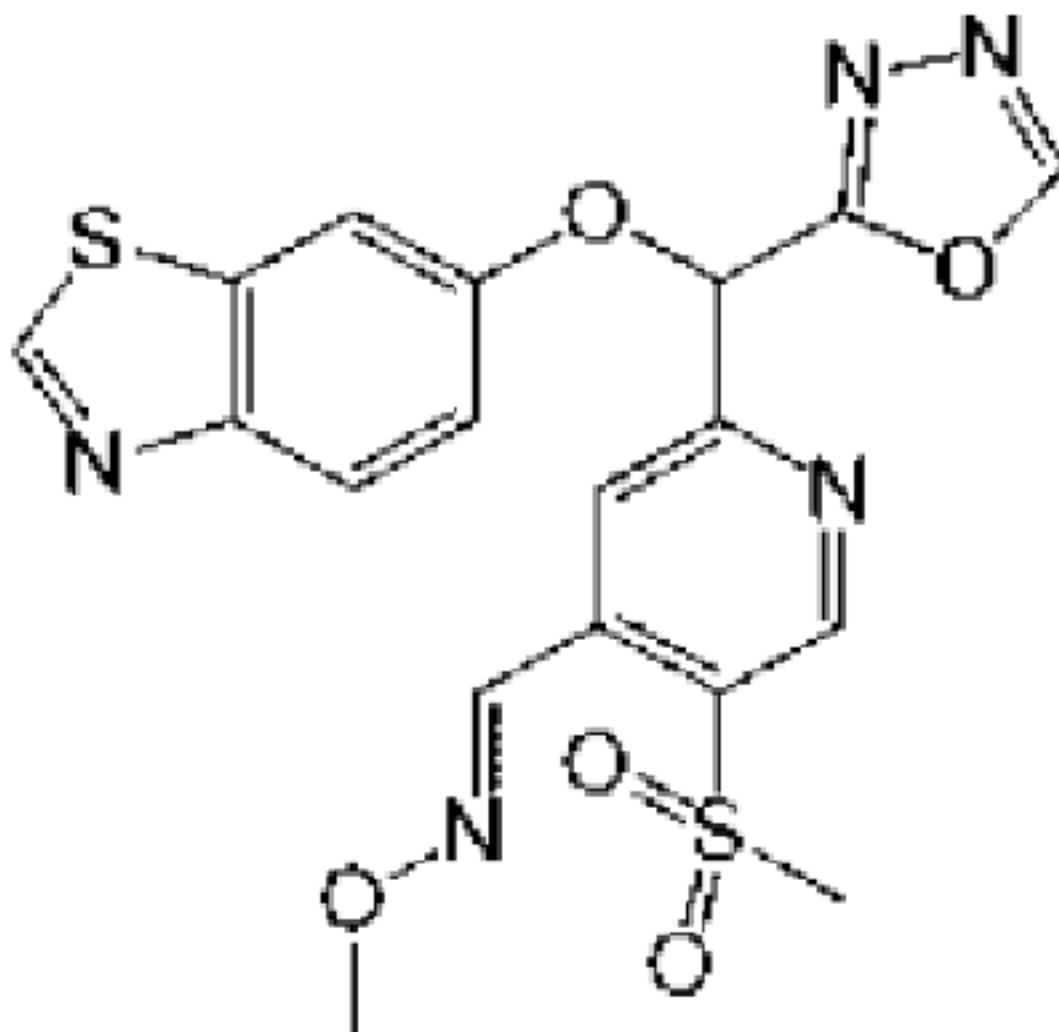
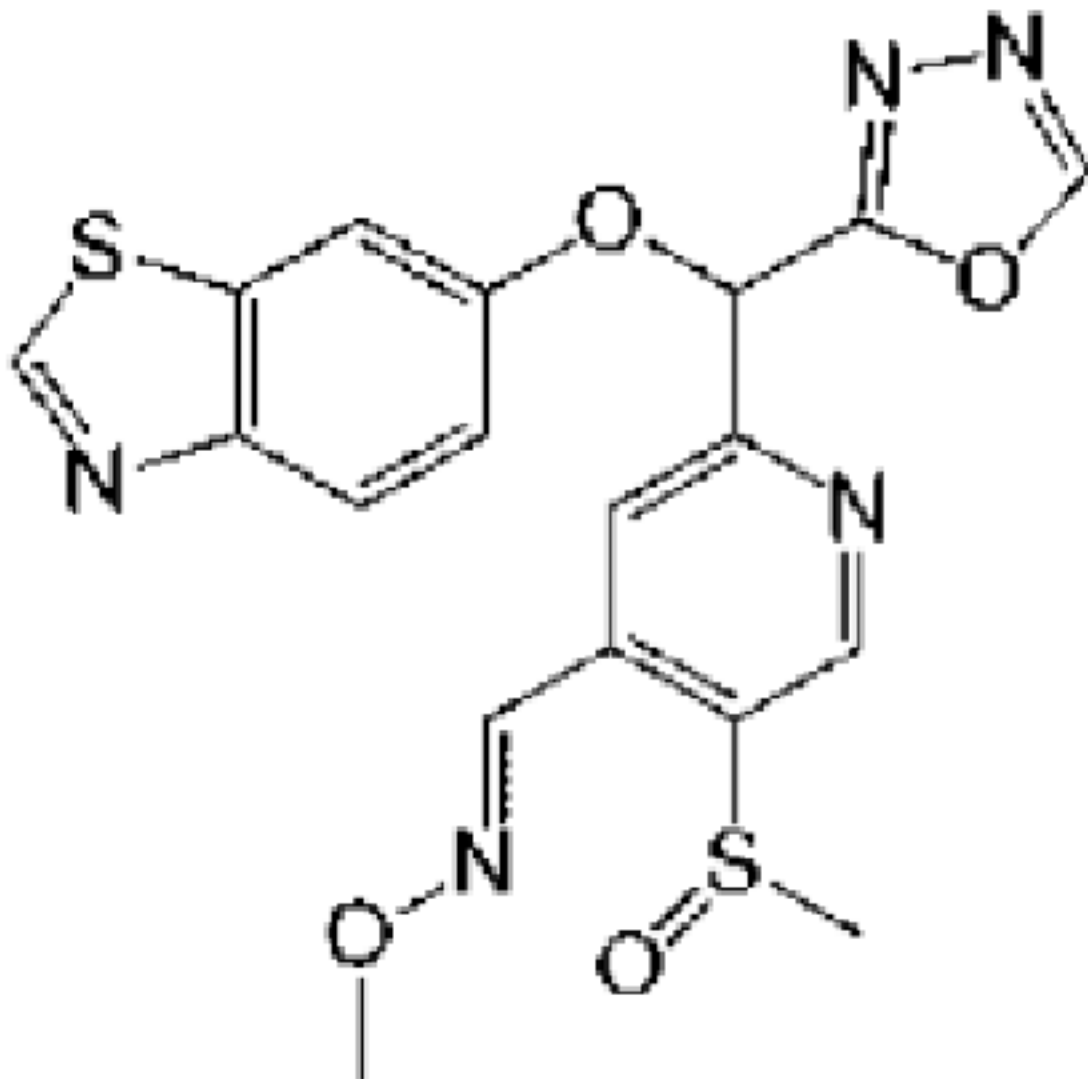
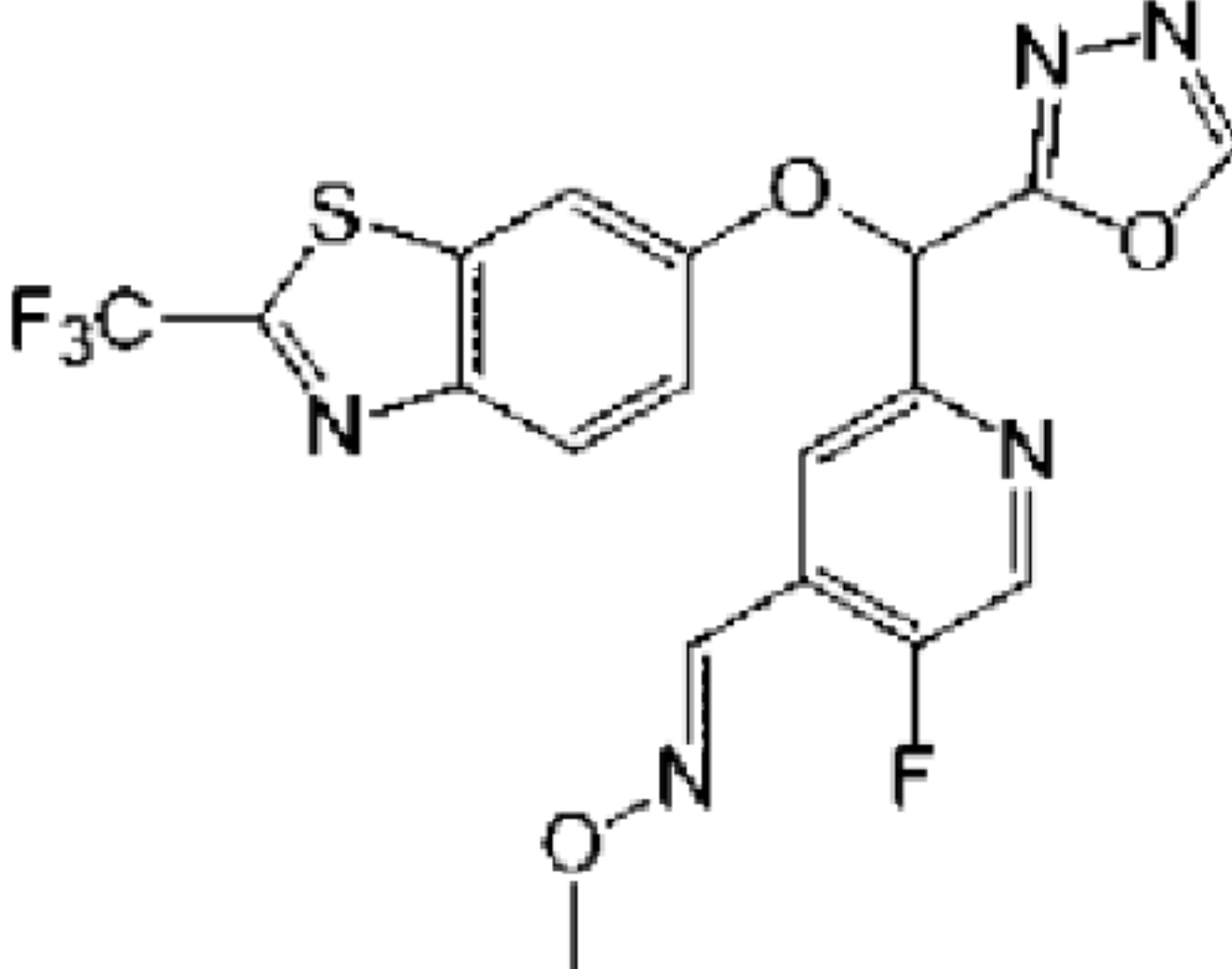
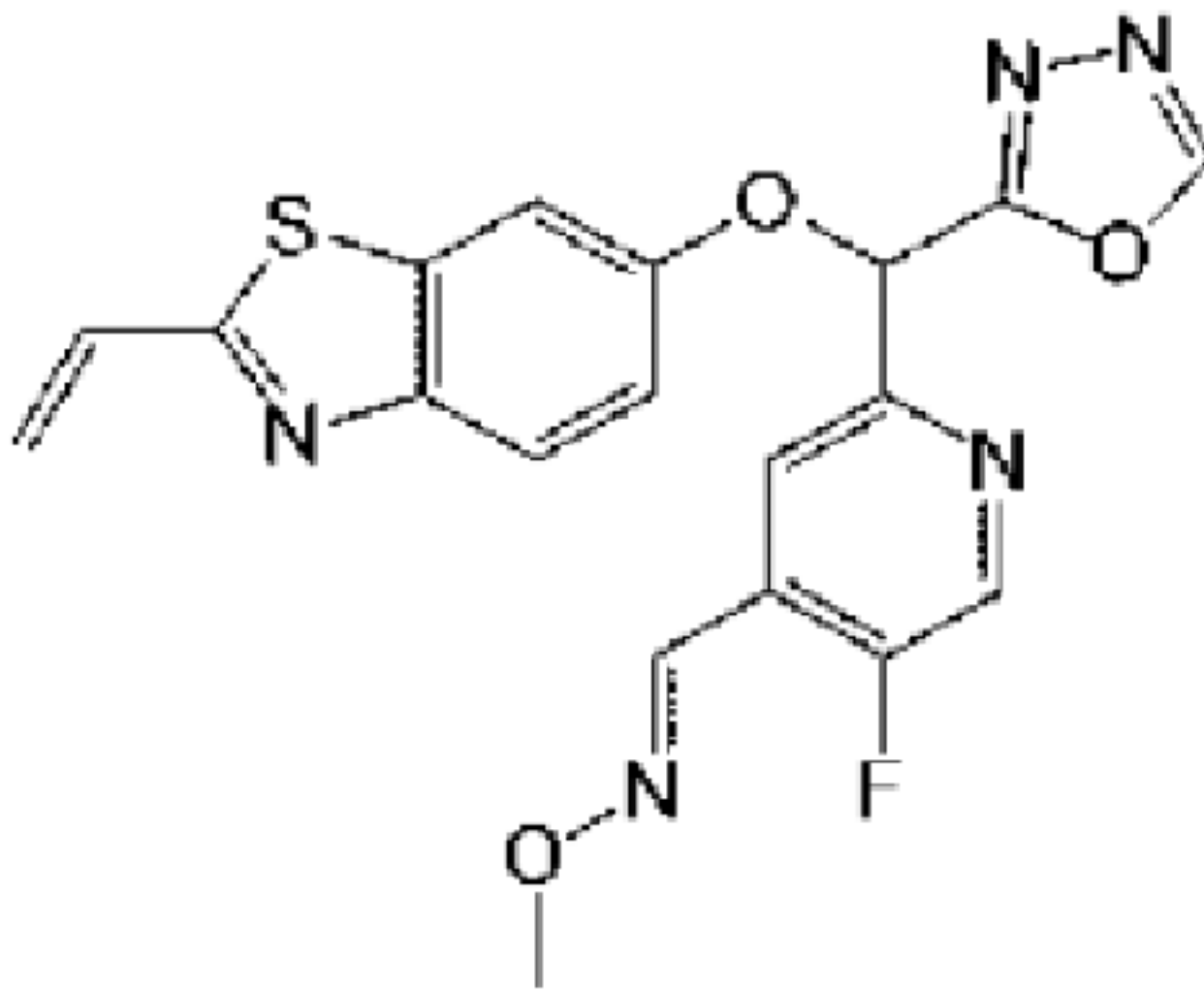
【0216】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-53		m.p. : 166-168°C
b-54		m.p. : 134-136°C
b-55		m.p. : 153-154°C
b-56		m.p. : 170-172°C
b-57		m.p. : 150-151°C

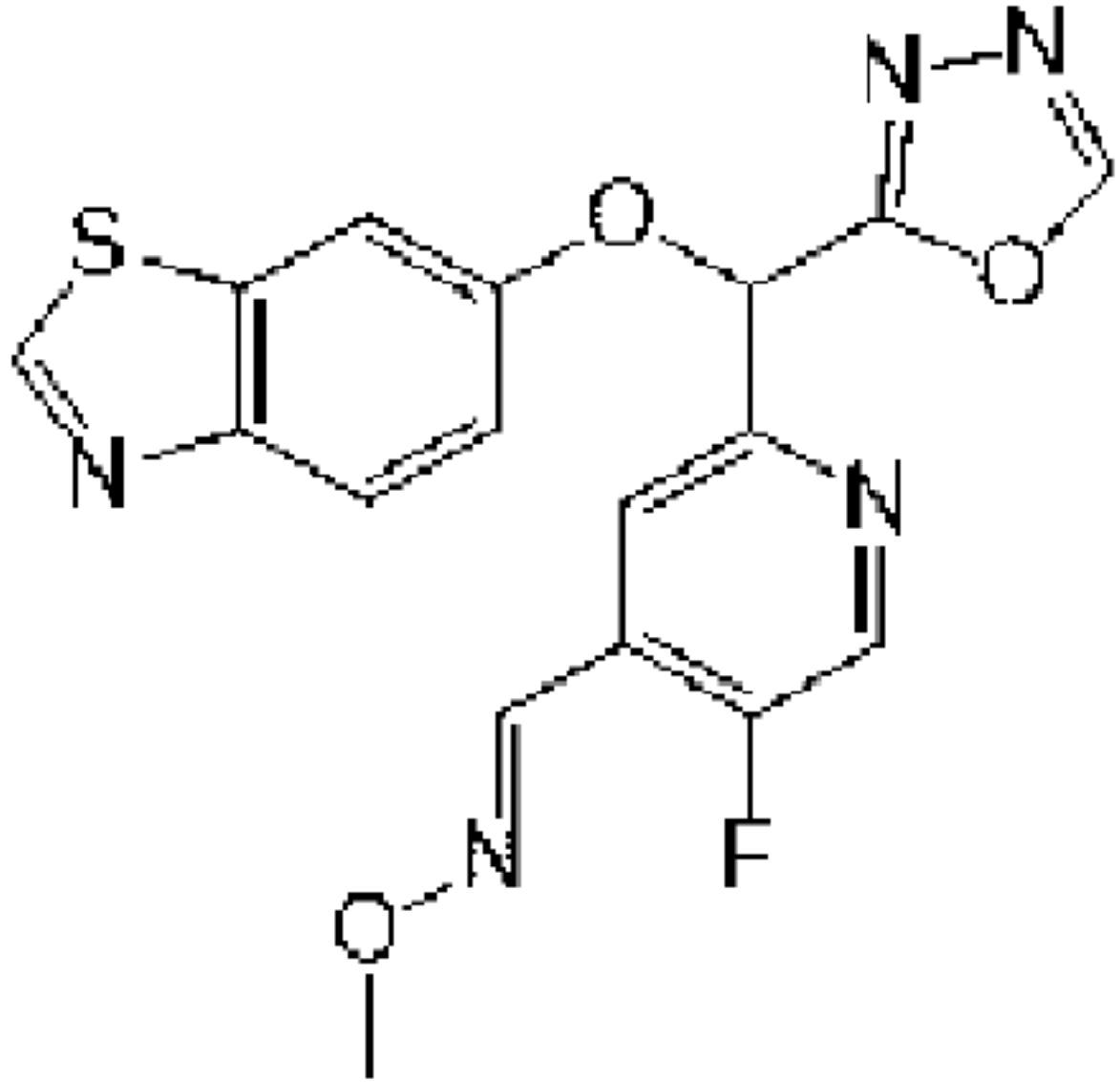
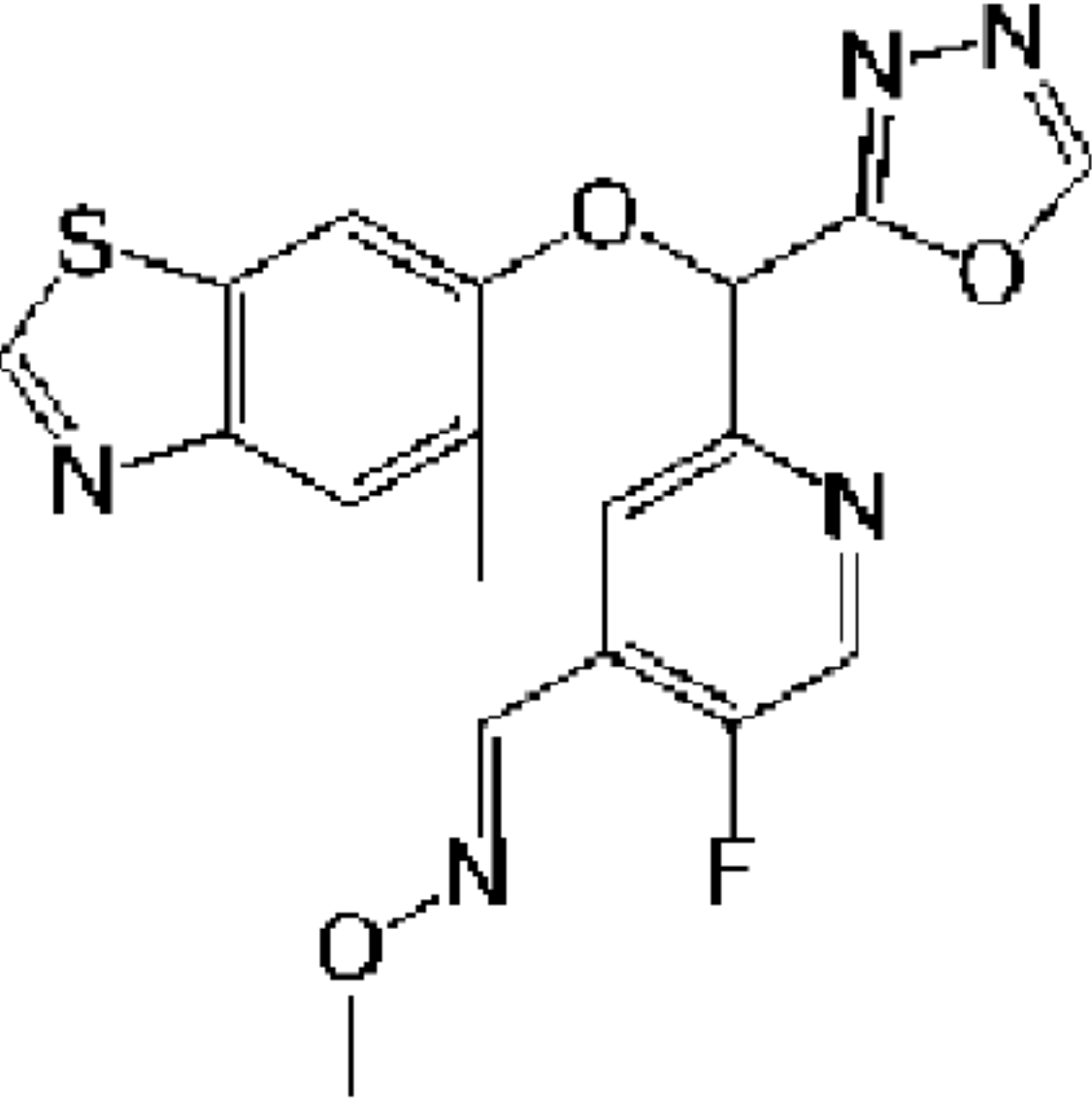
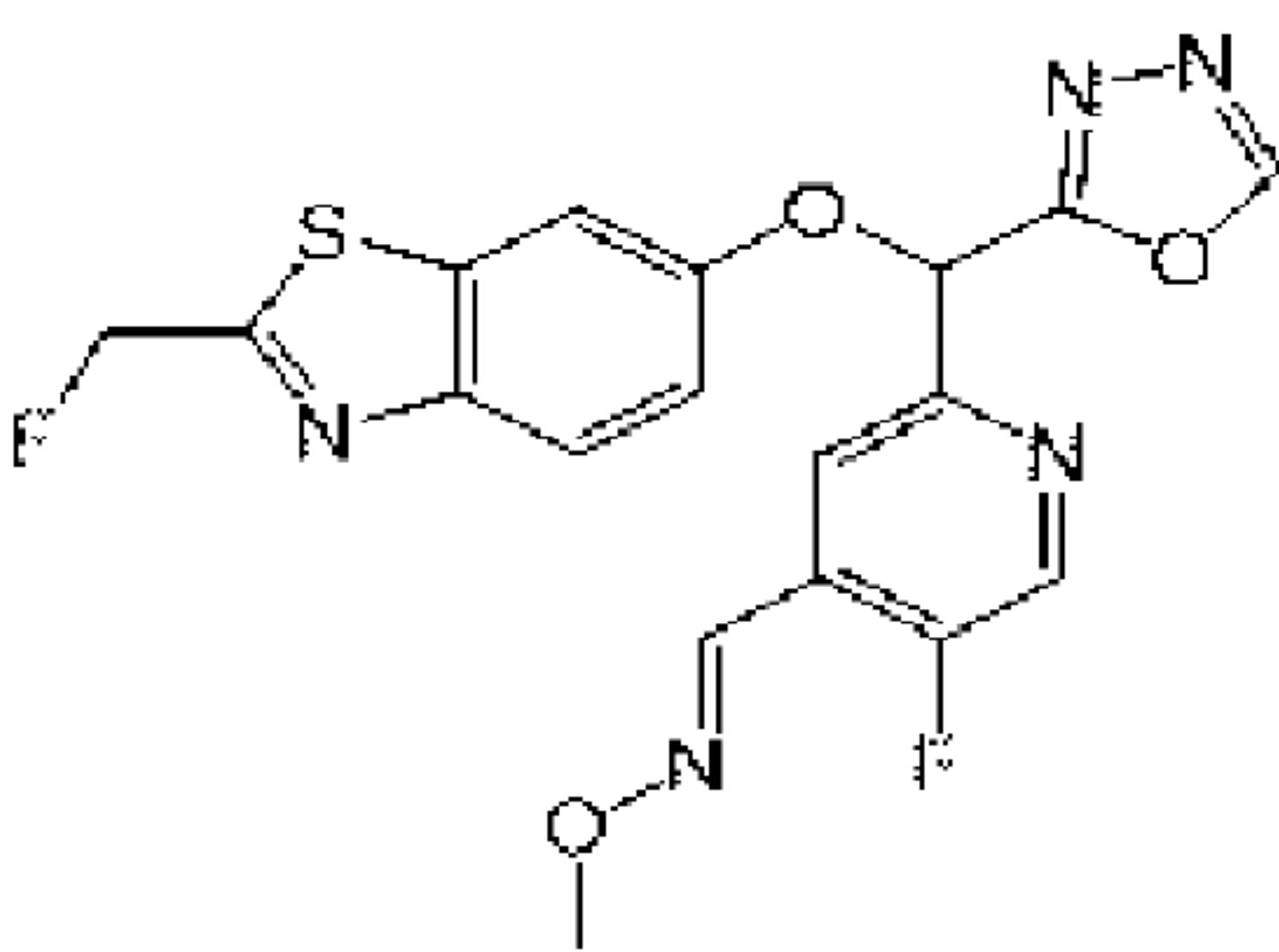
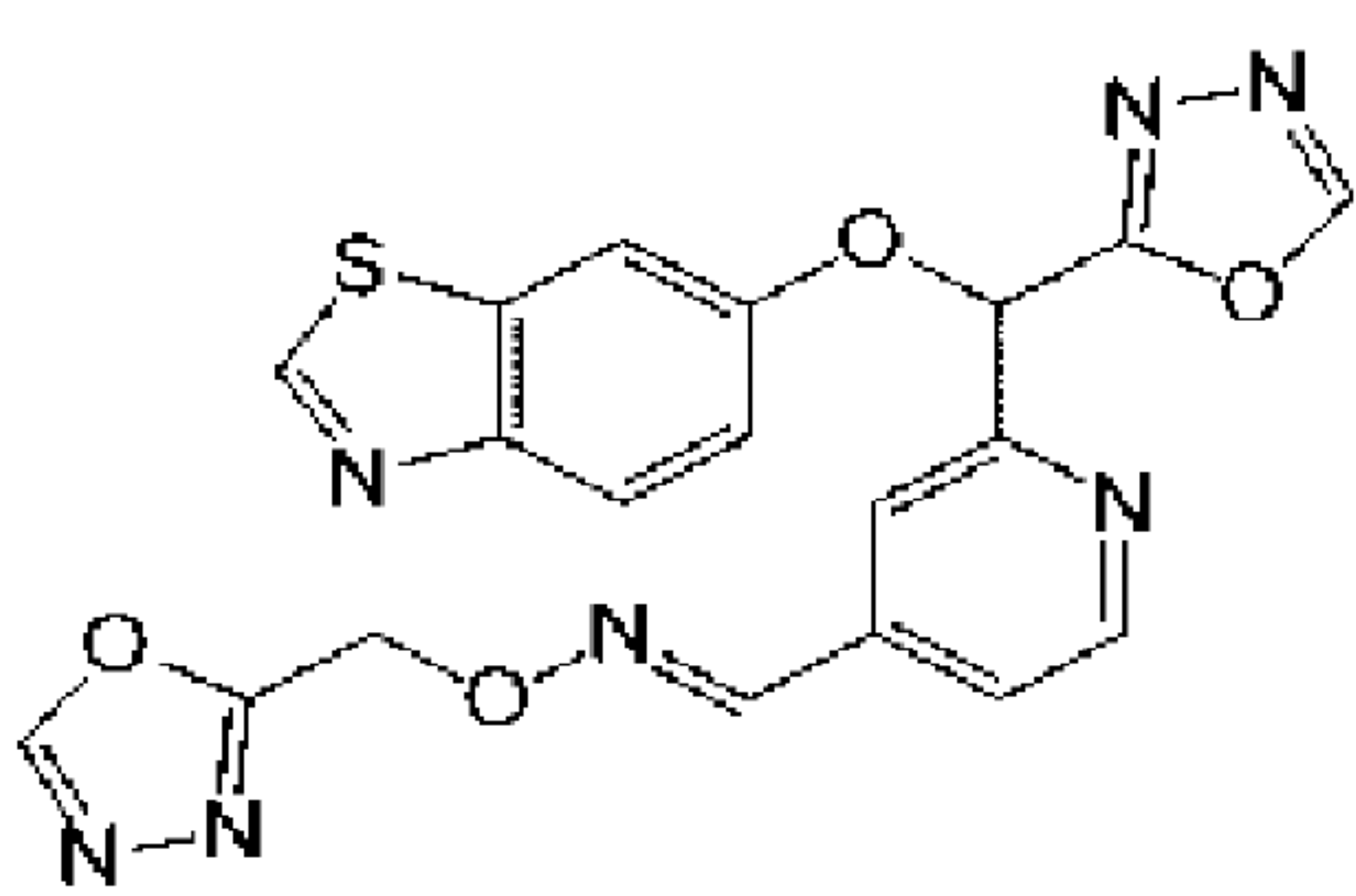
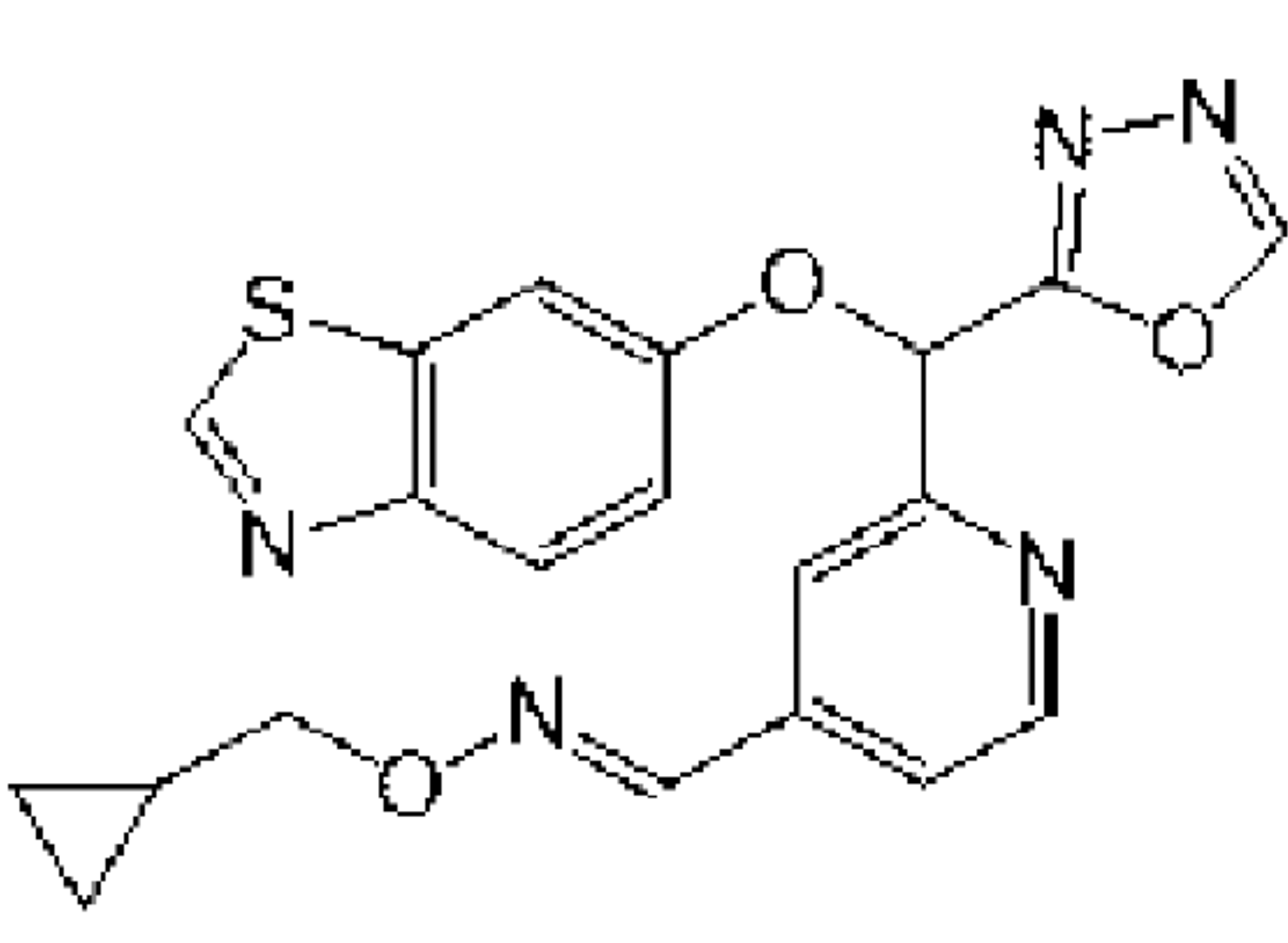
【0217】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-58		m.p. : 134-135°C
b-59		黏性油
b-60		m.p. : 90-93°C
b-61		m.p. : 85-88°C
b-62		m.p. : 113-114°C
b-63		m.p. : 88-89°C

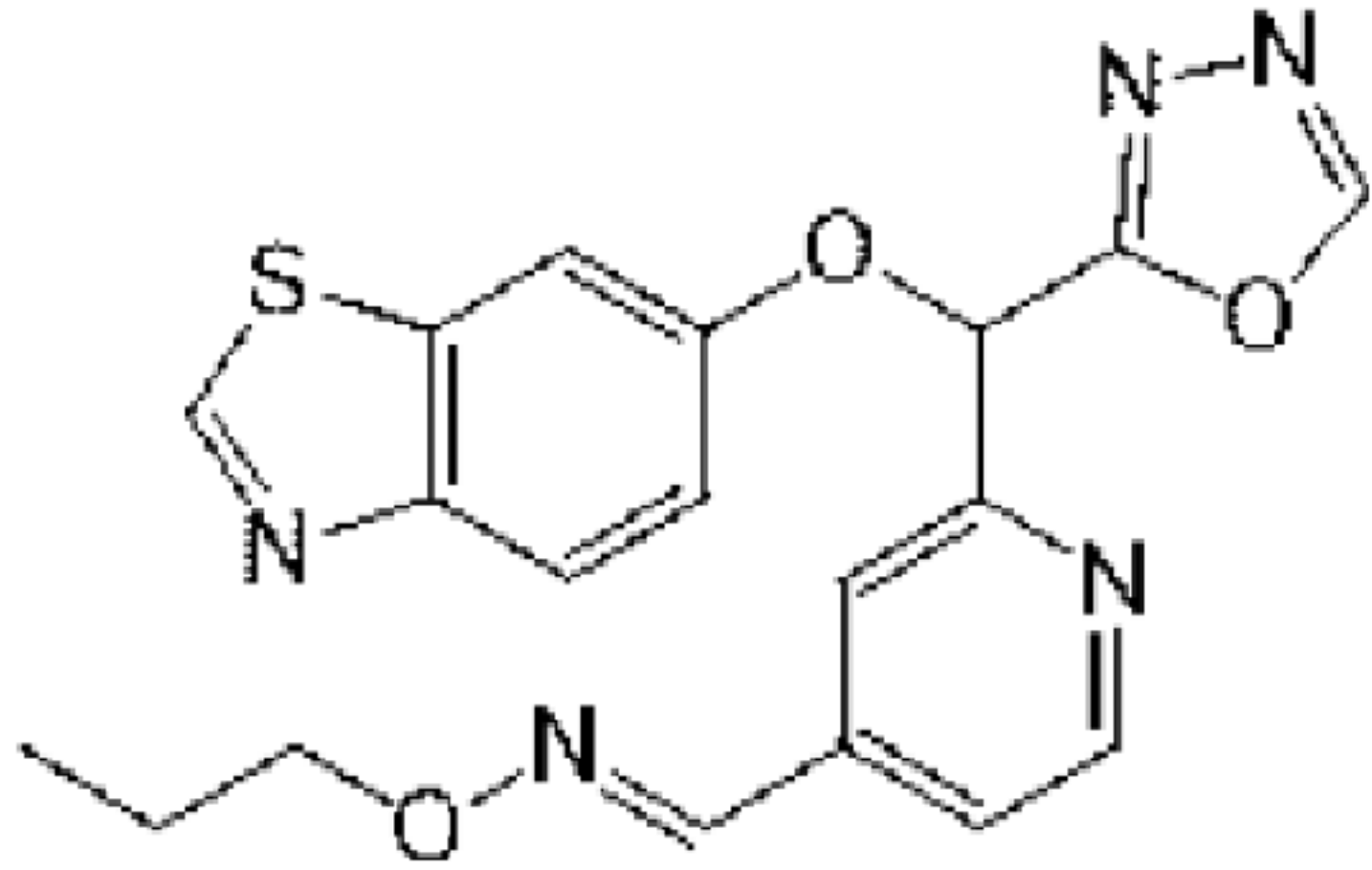
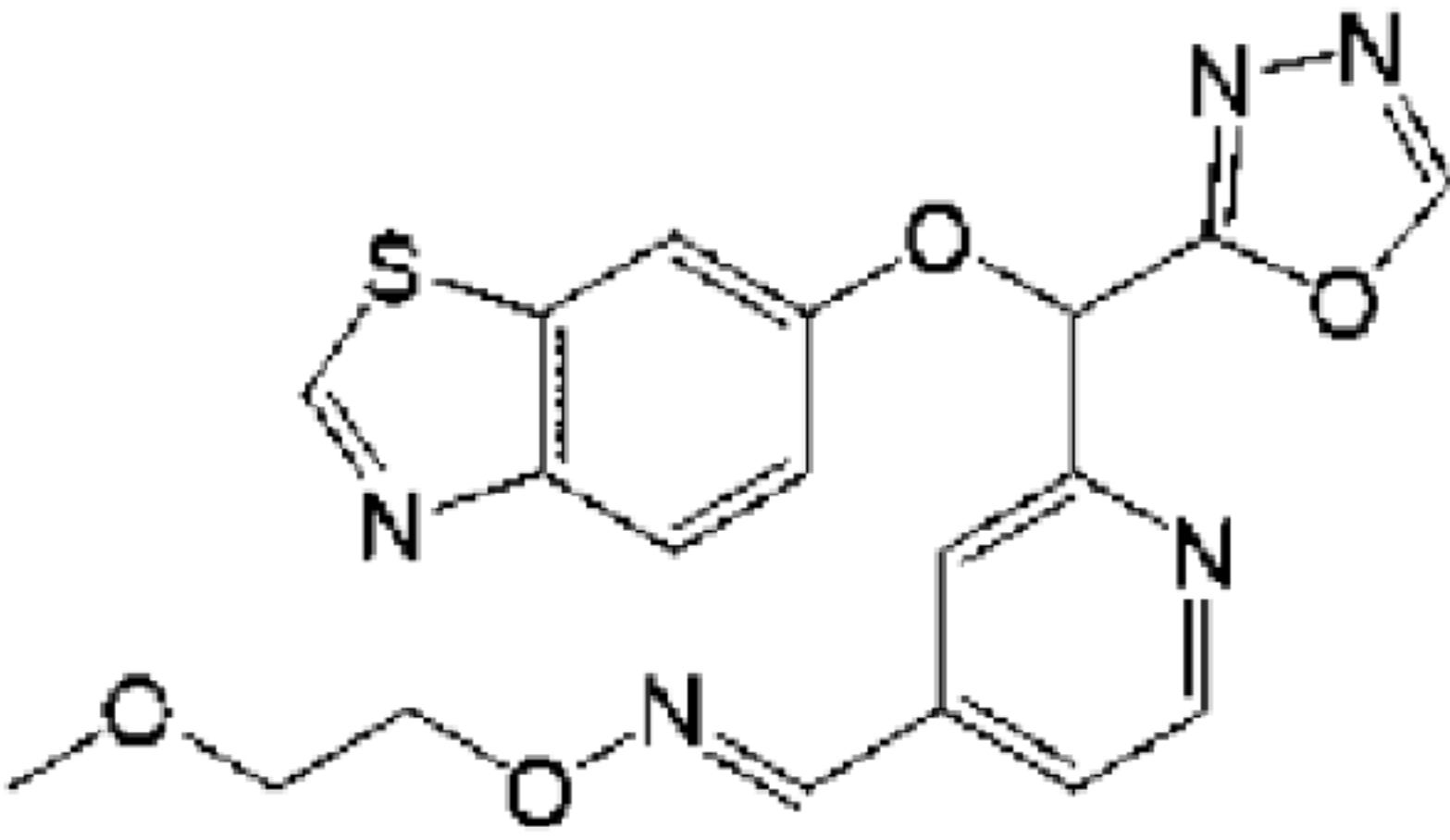
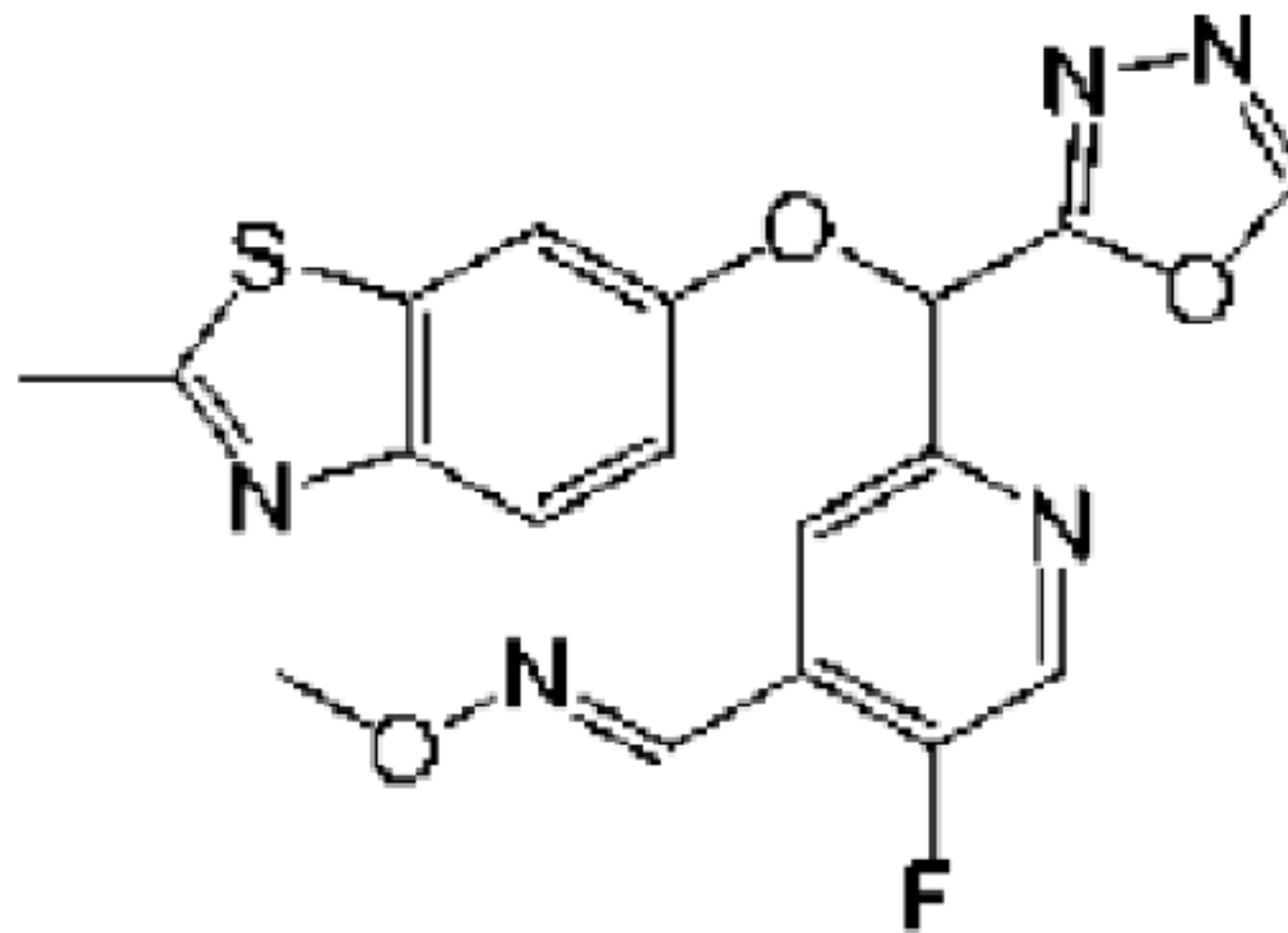
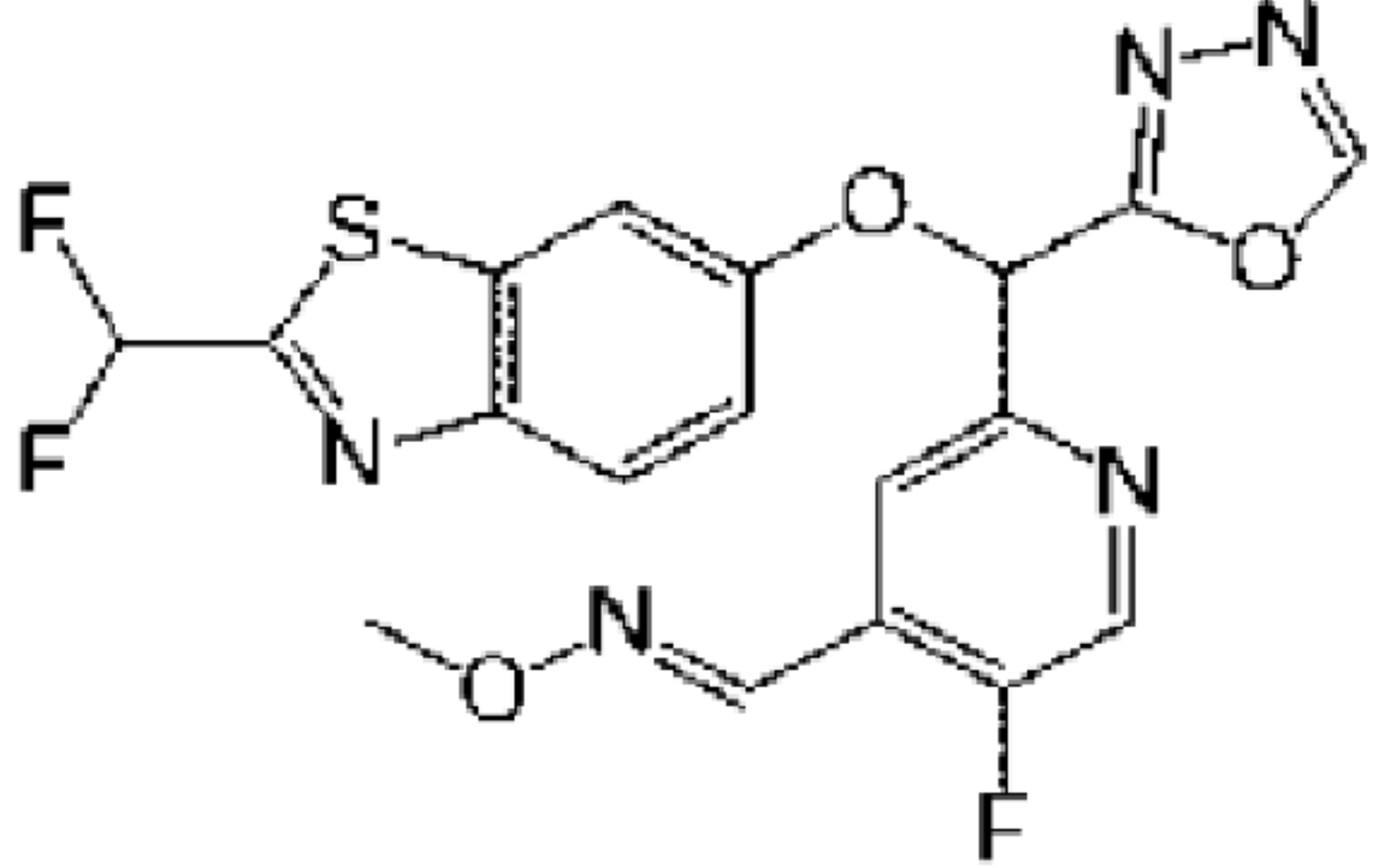
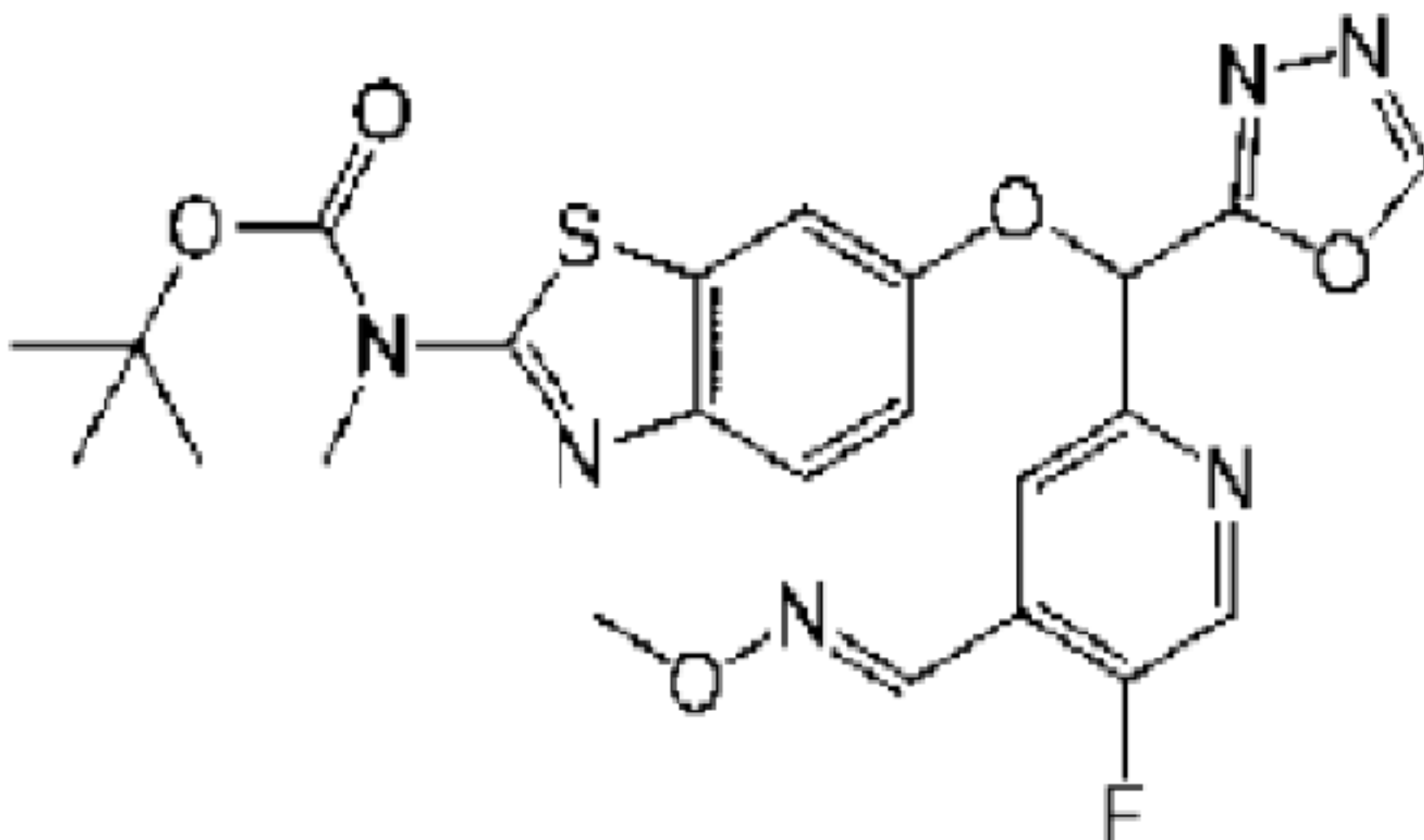
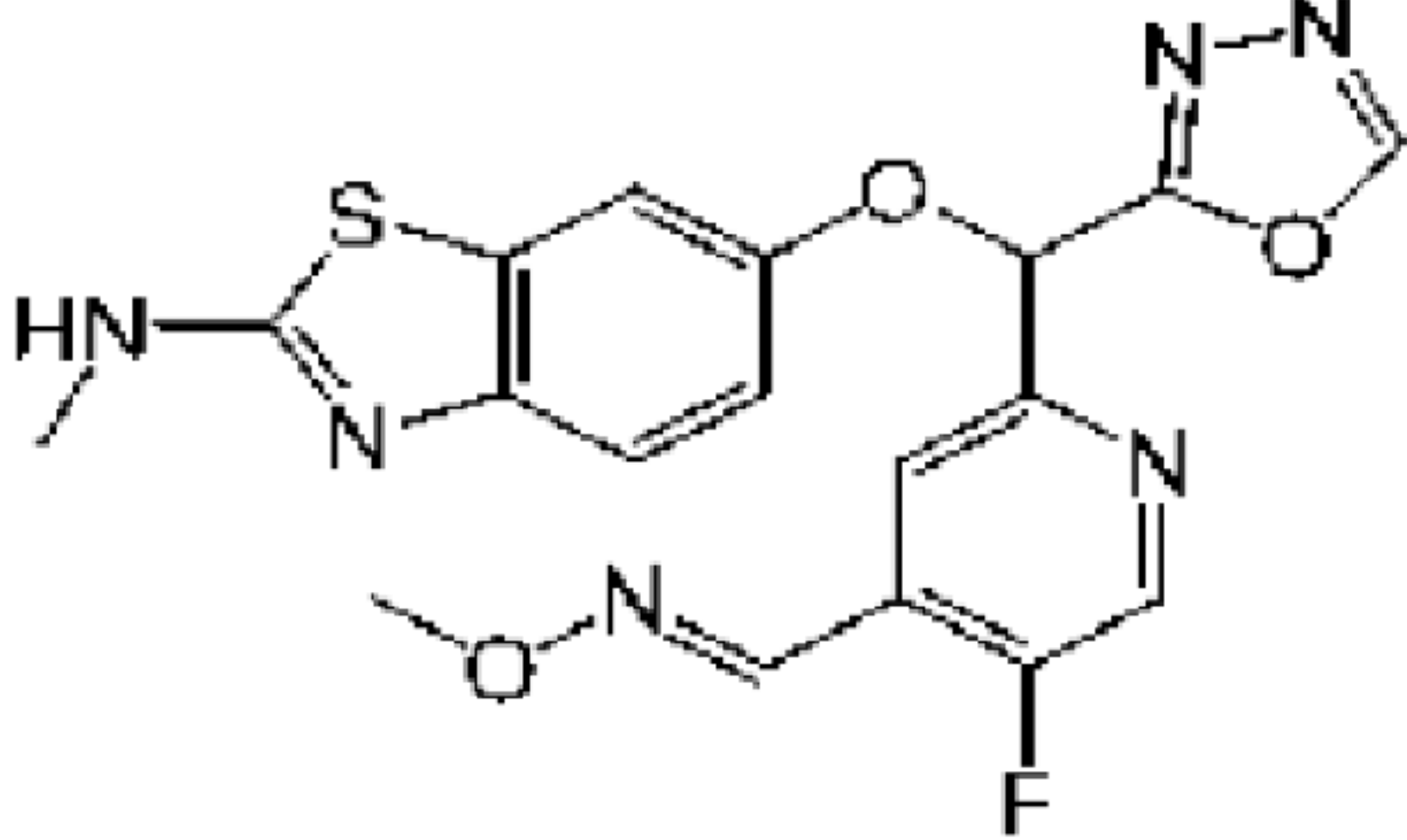
【0218】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-64		m.p. : 176-178°C
b-65		m.p. : 179-180°C
b-66		m.p. : 133-134°C
b-67		非晶形
b-68		n _D (20.7°C) 1.6004

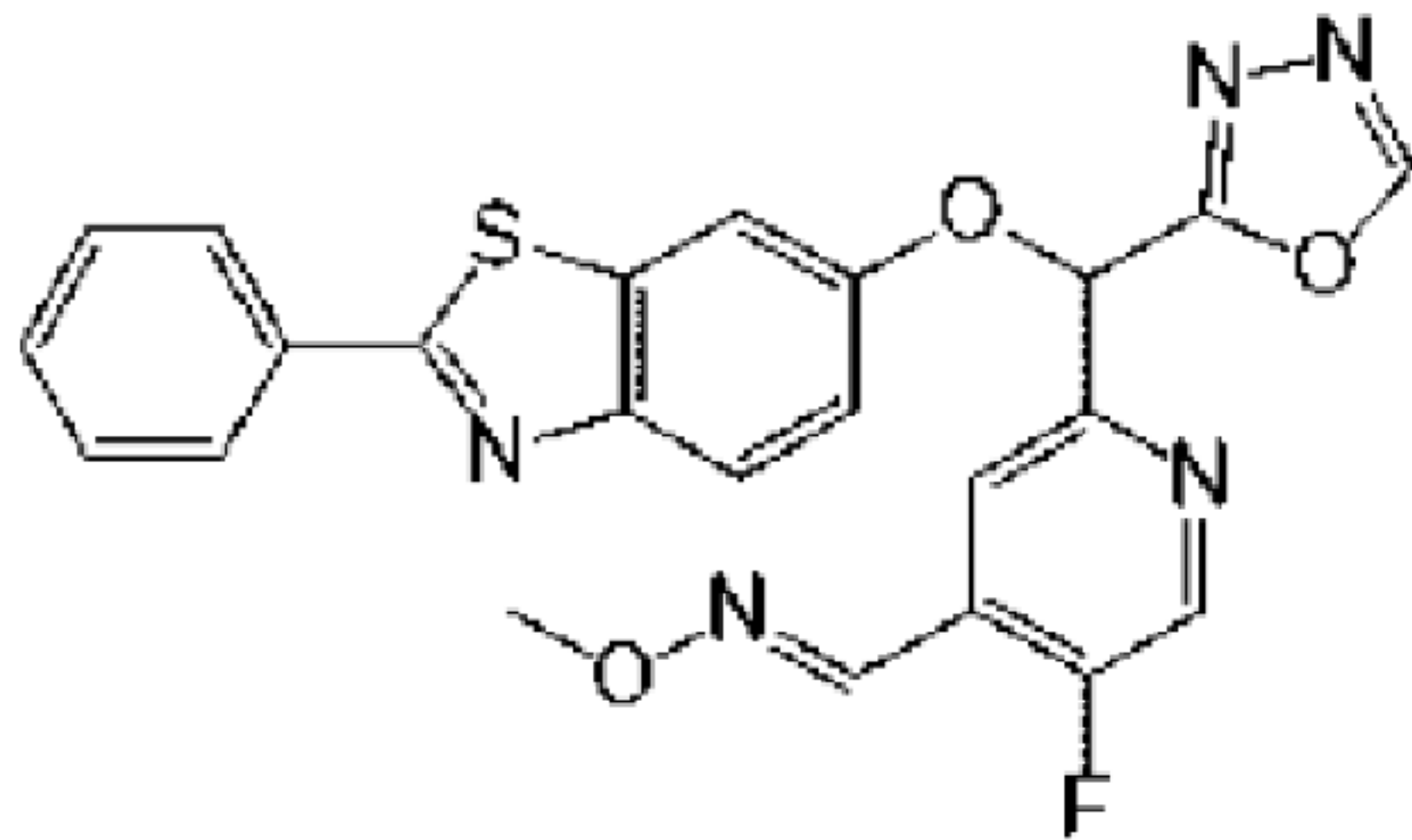
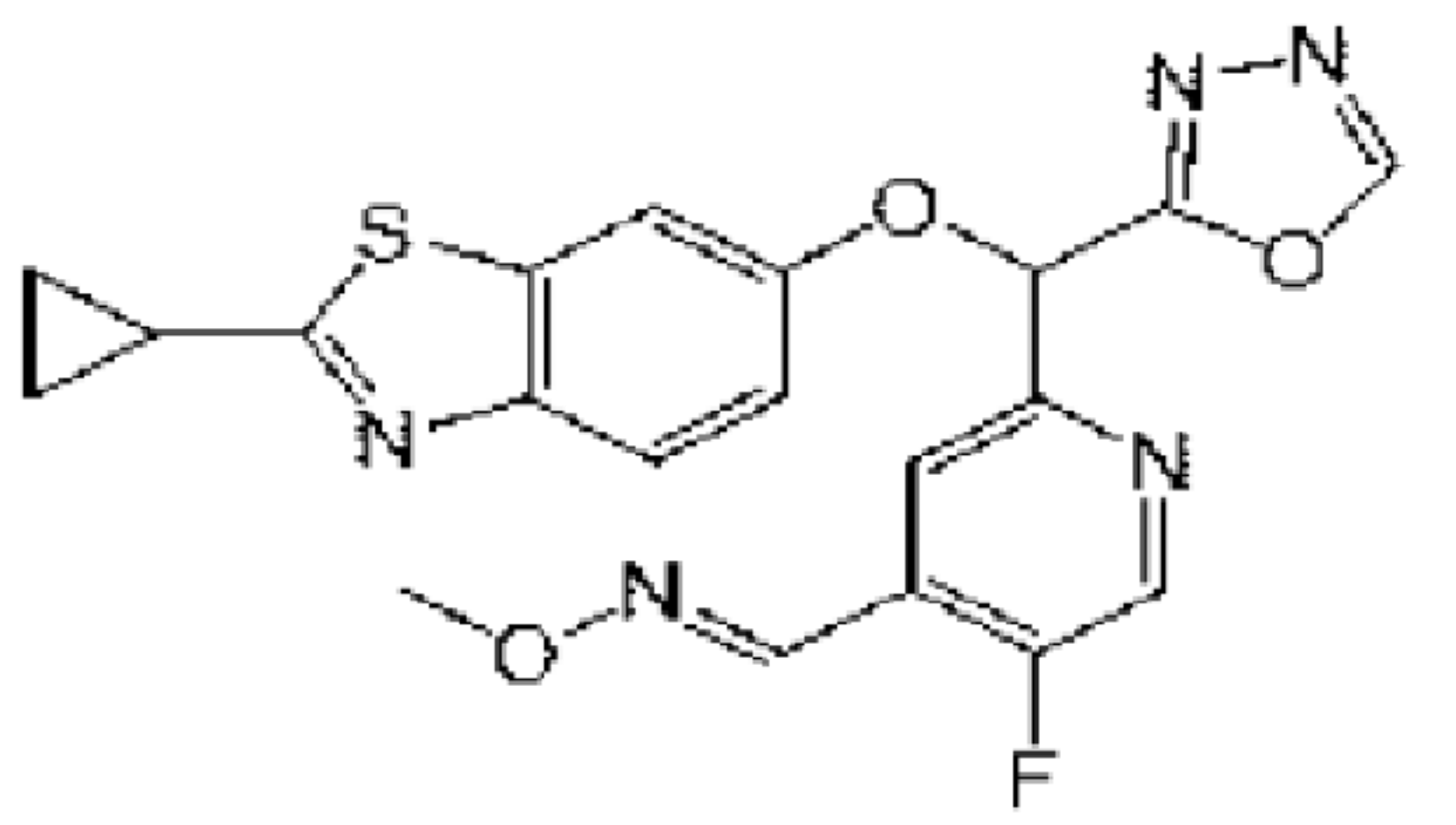
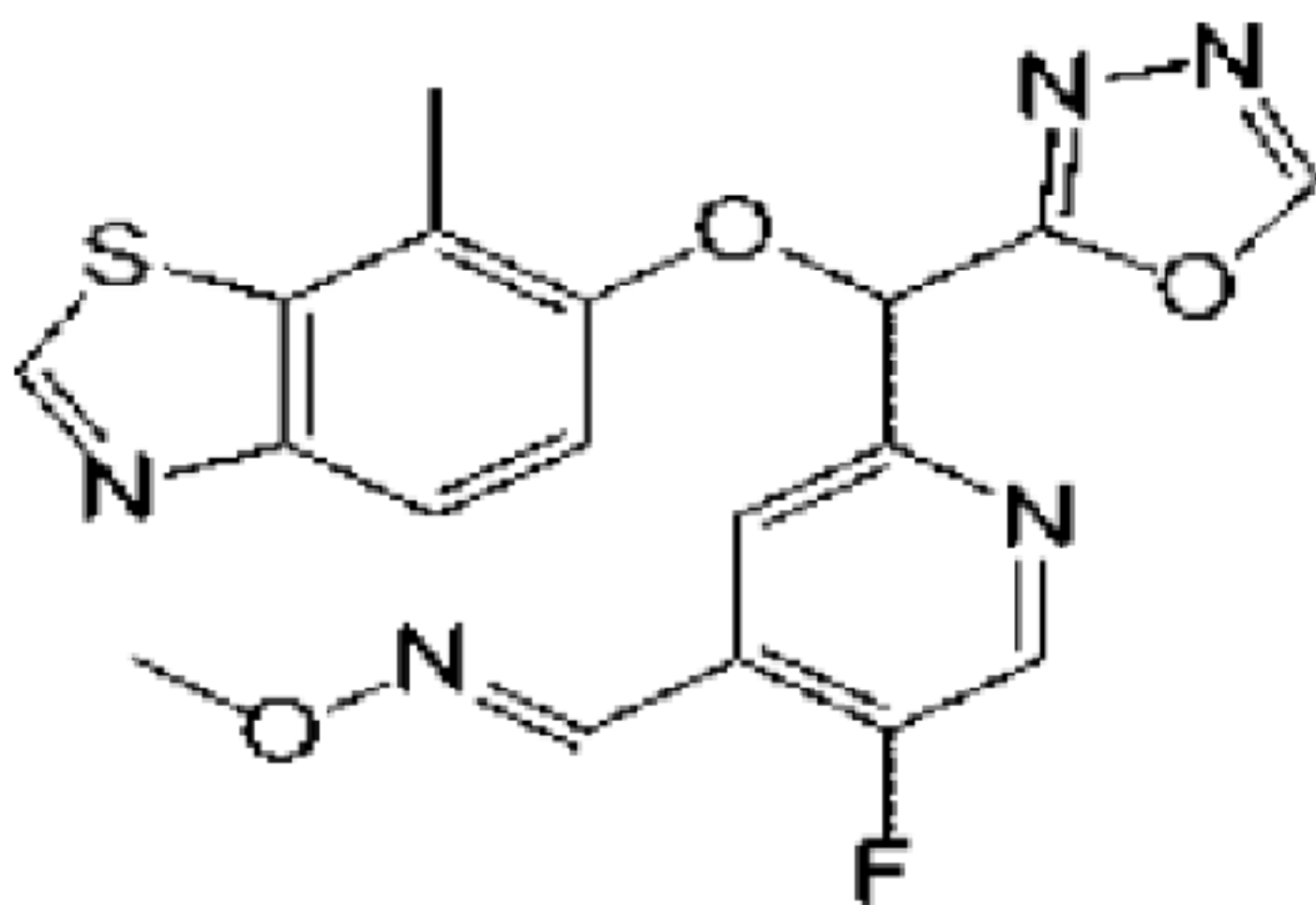
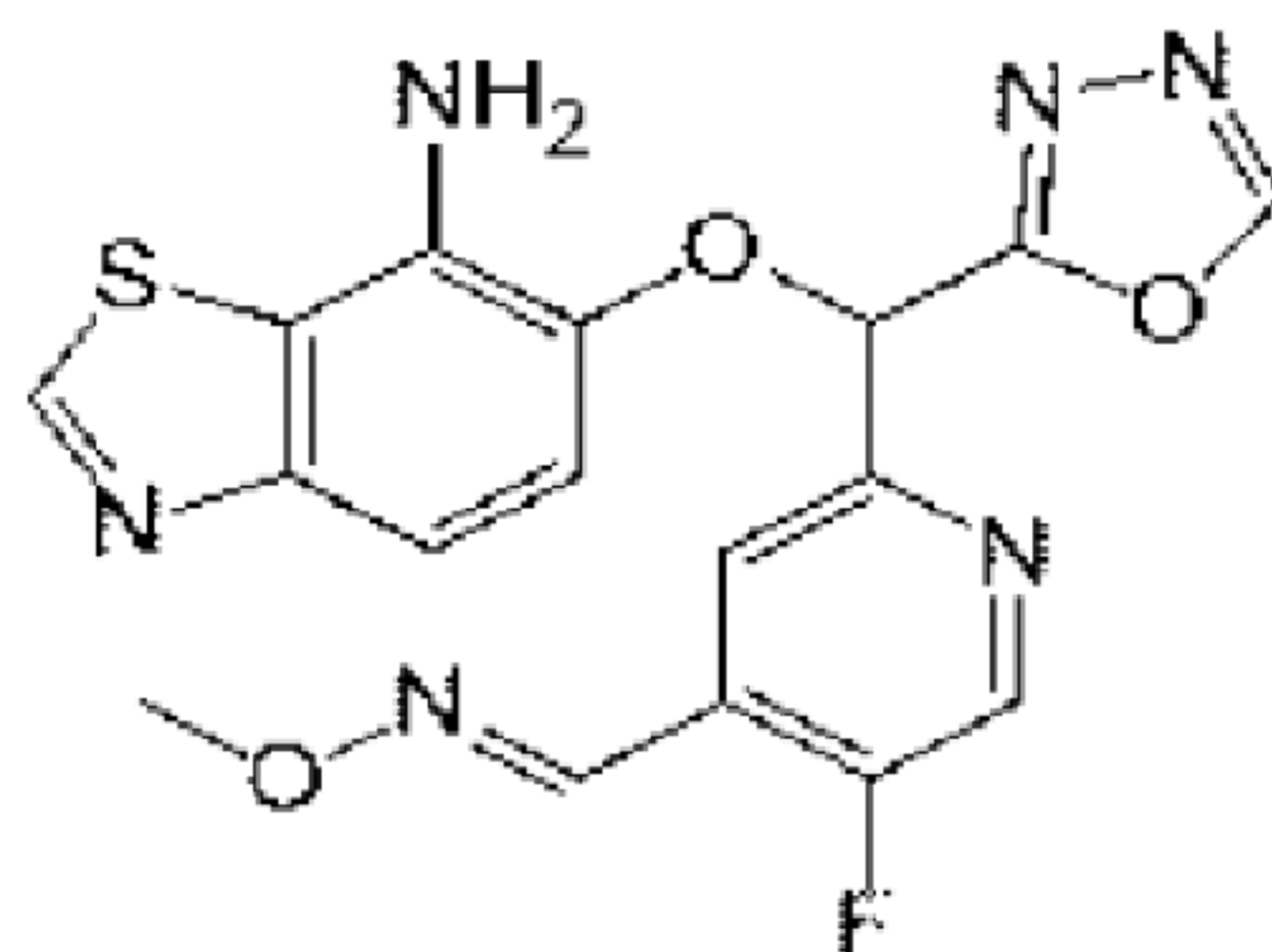
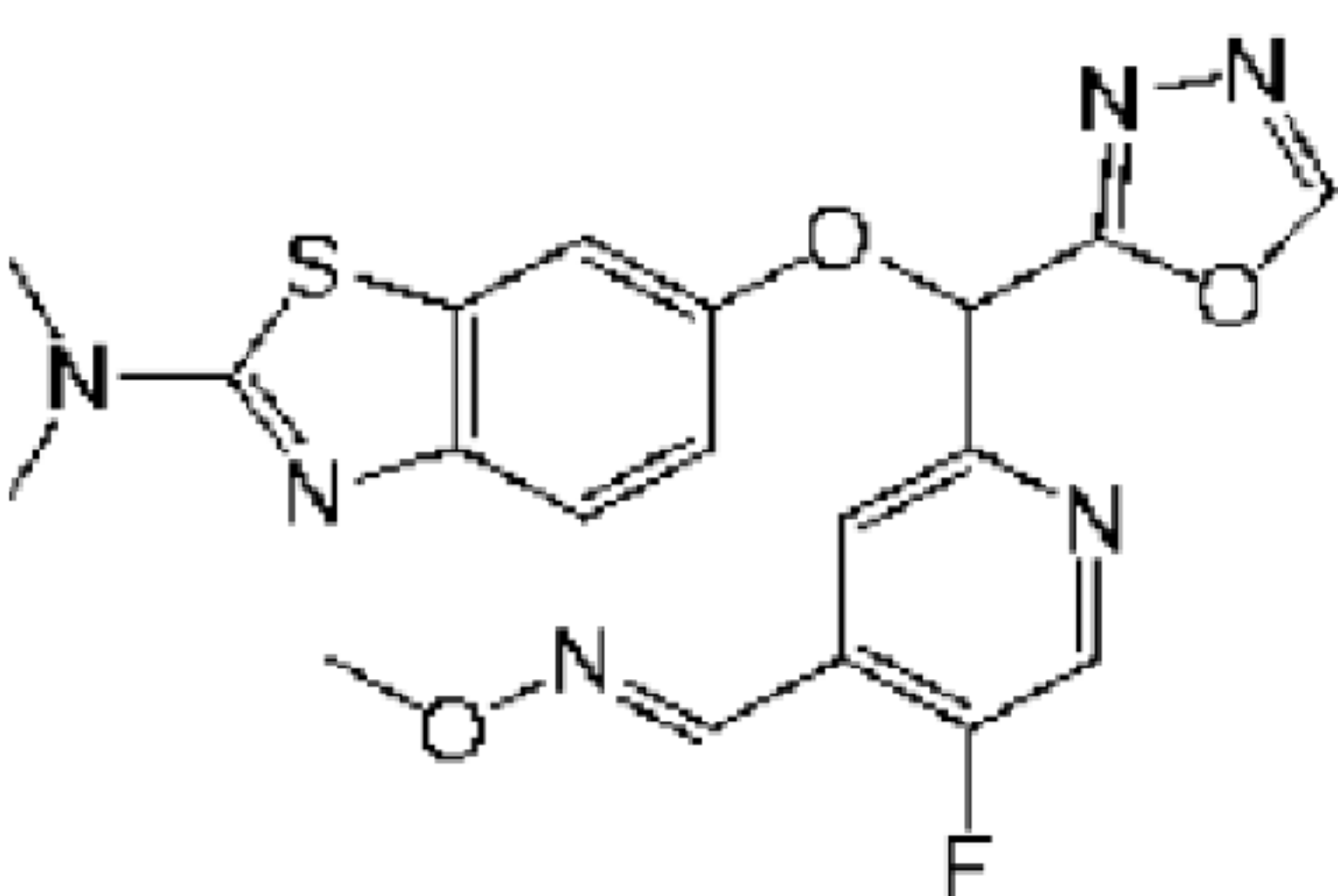
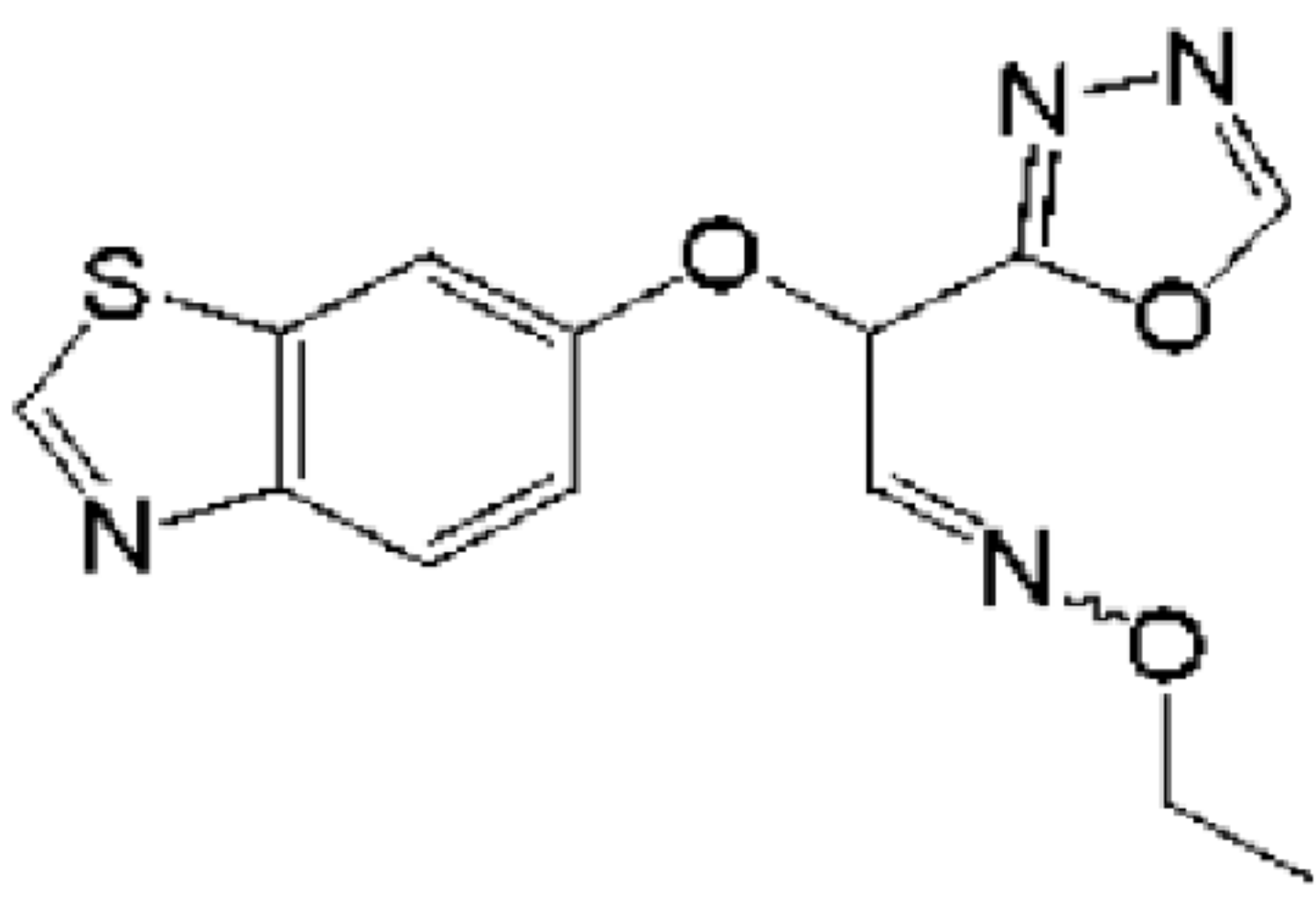
【0219】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-69		n _D (20.6°C) 1.6053
b-70		非晶形
b-71		m.p. : 167-168°C
b-72		m.p. : 143-144°C
b-73		m.p. : 157-158°C
b-74		m.p. : 181-182°C

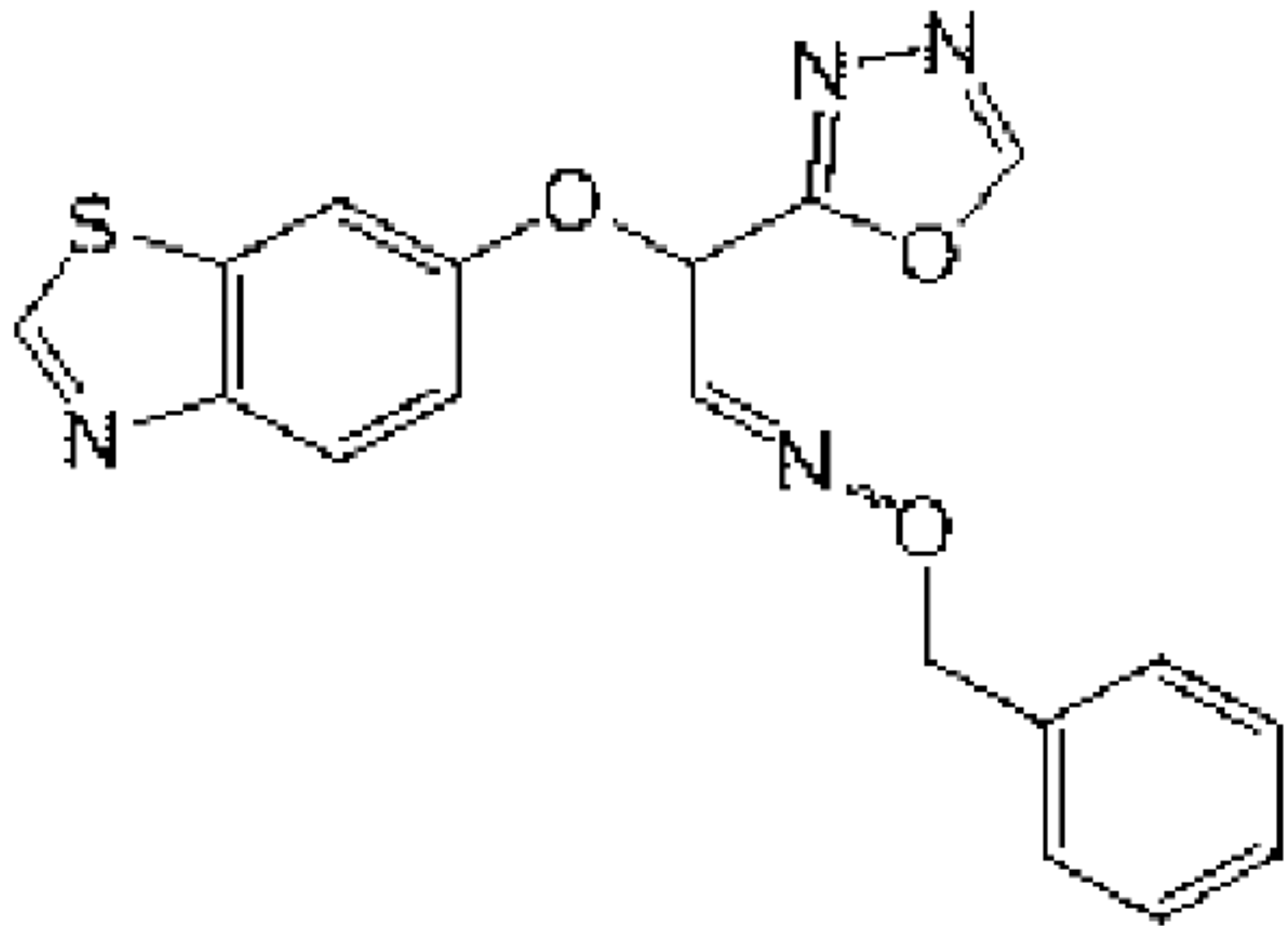
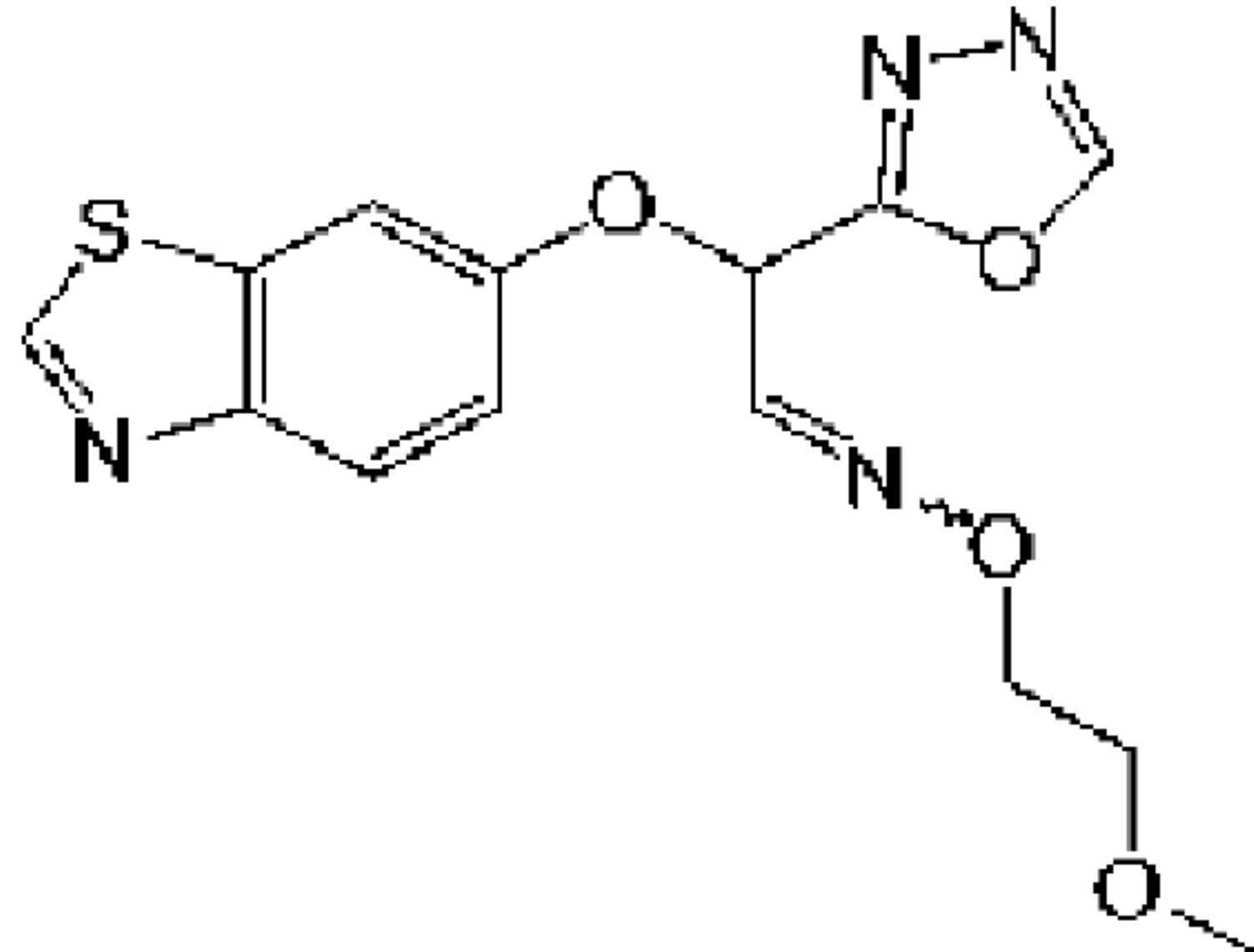
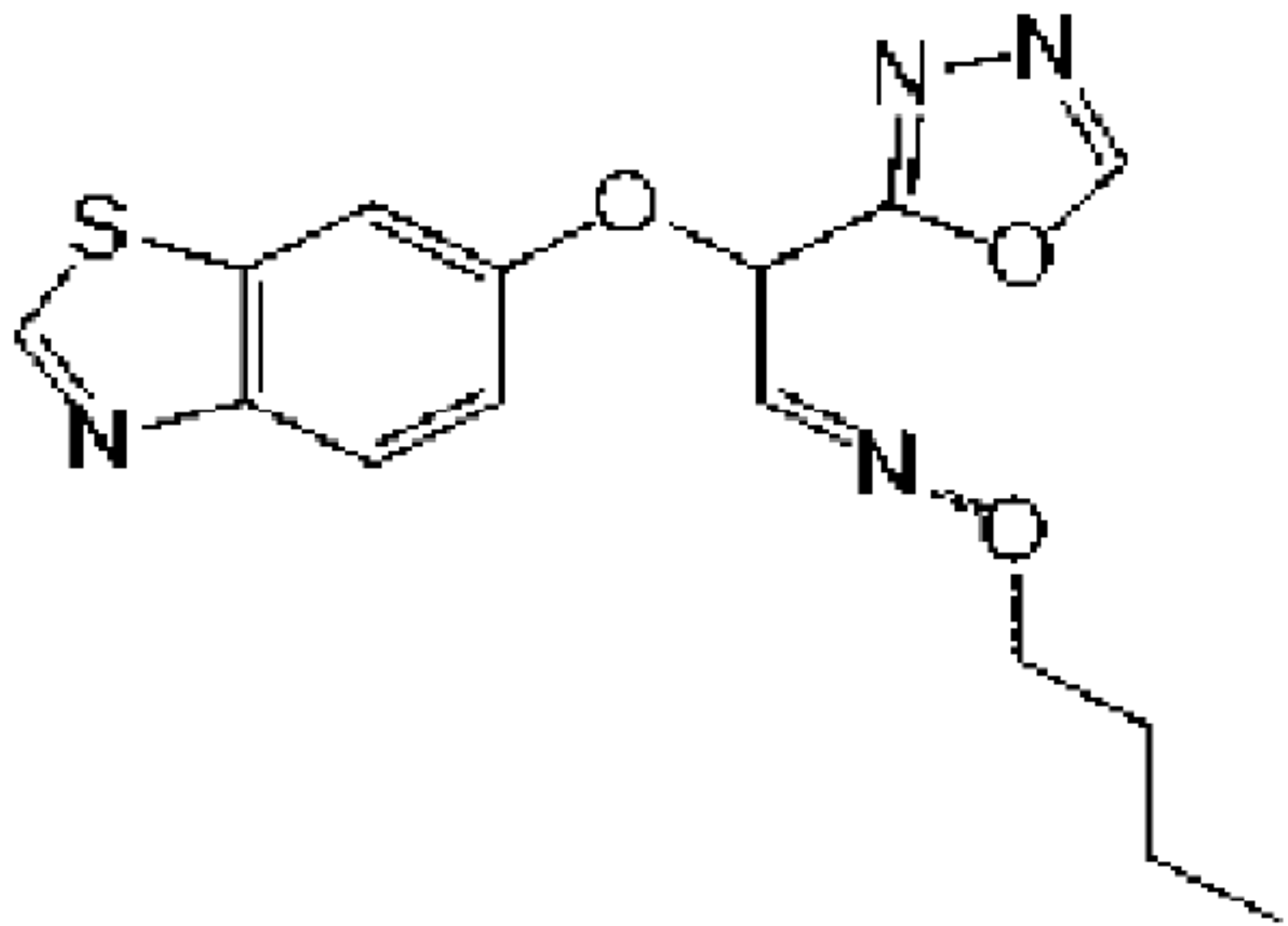
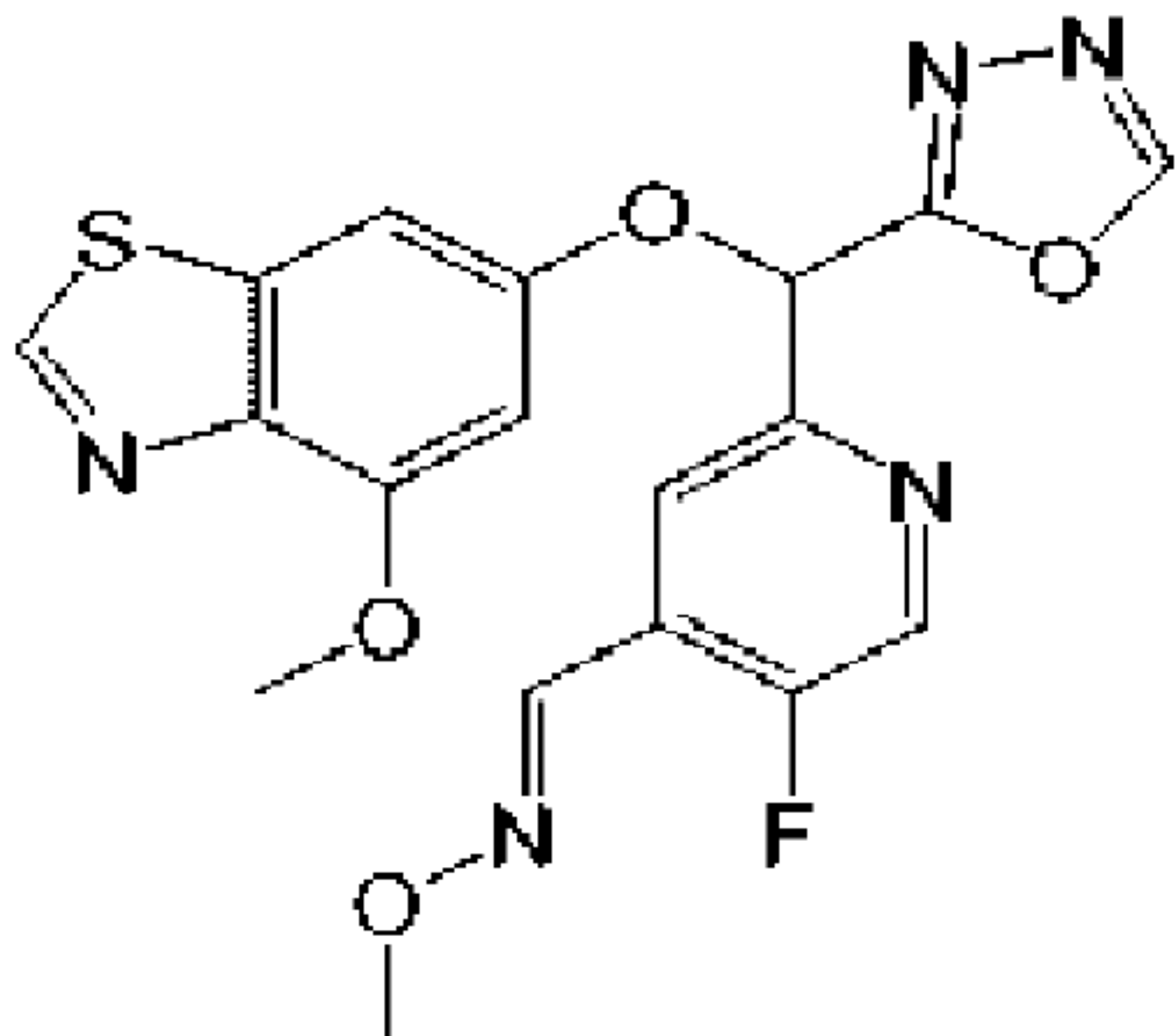
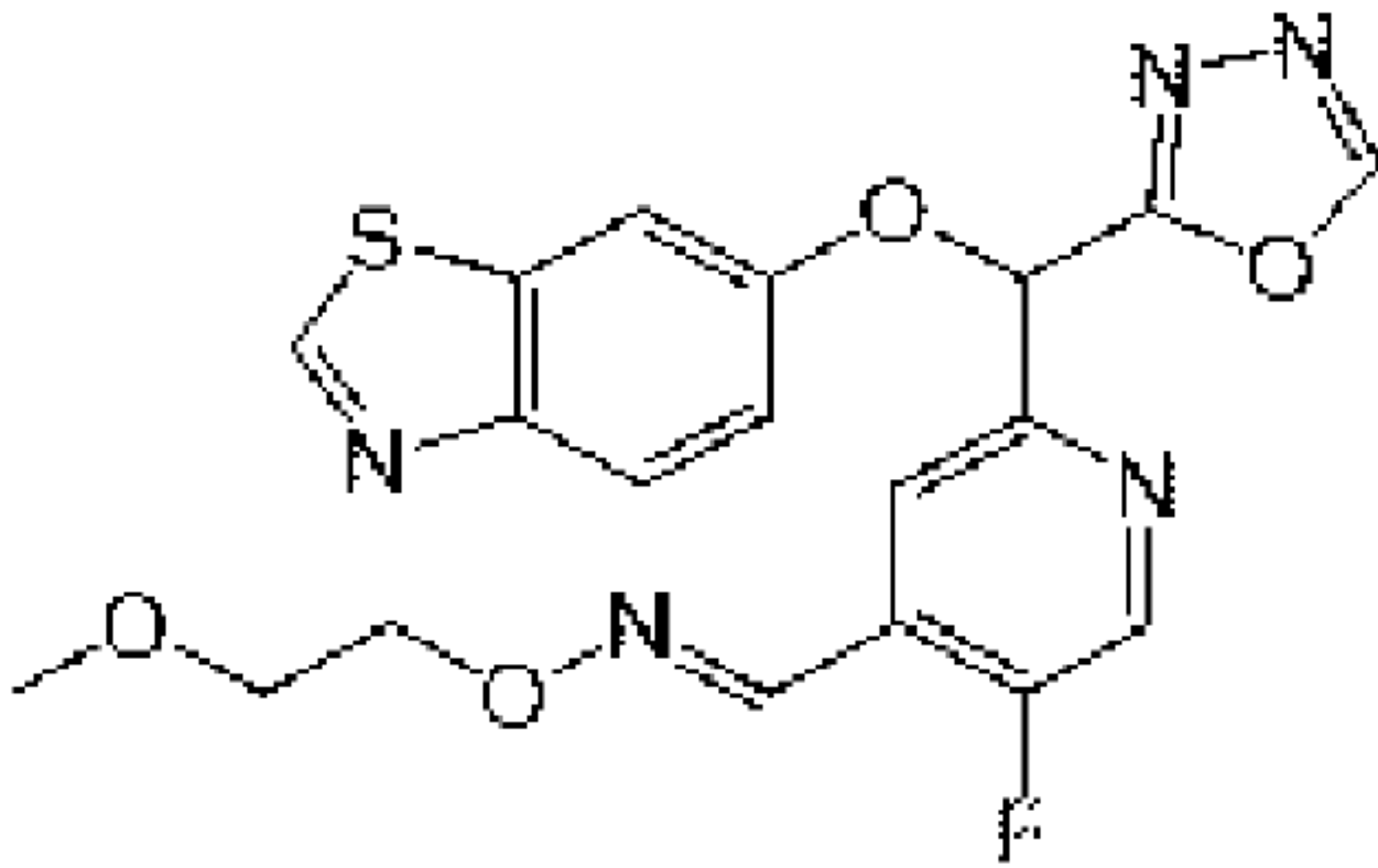
【0220】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-75		m.p. : 182-183°C
b-76		m.p. : 103-104°C
b-77		m.p. : 108-110°C
b-78		n _D (20.8°C) 1.6153
b-79		m.p. : 103-104°C
b-80		n _D (20.6°C) 1.5753

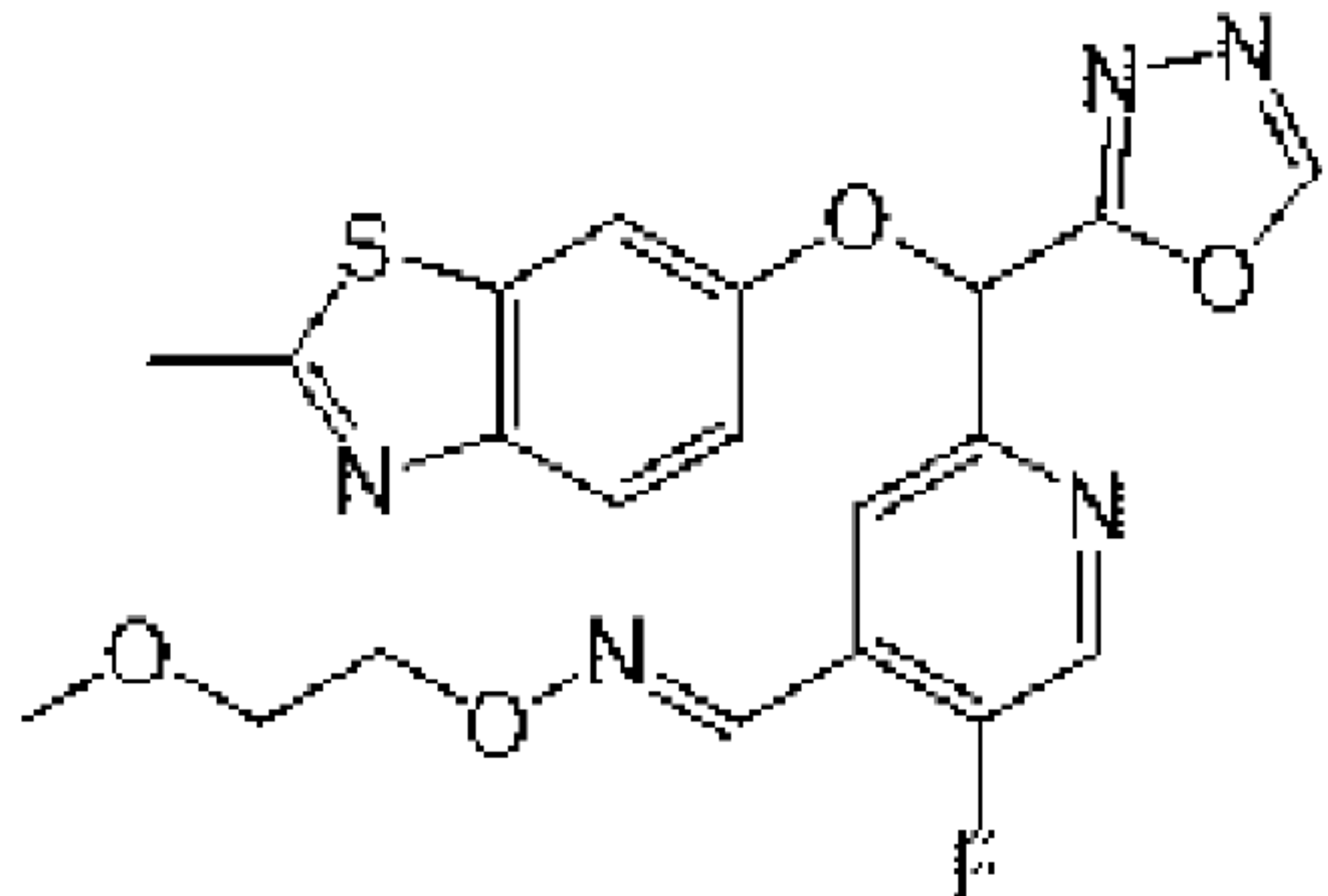
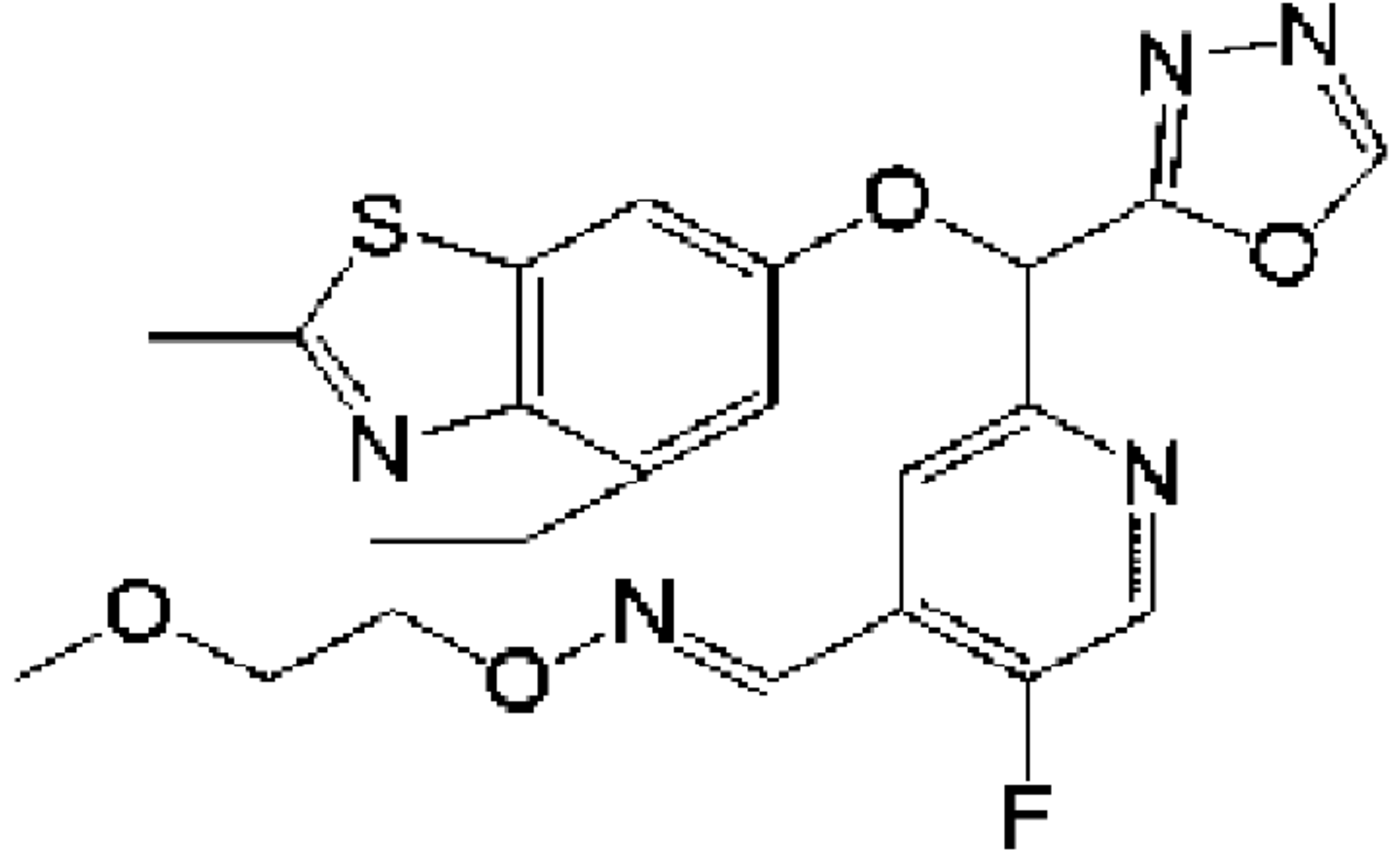
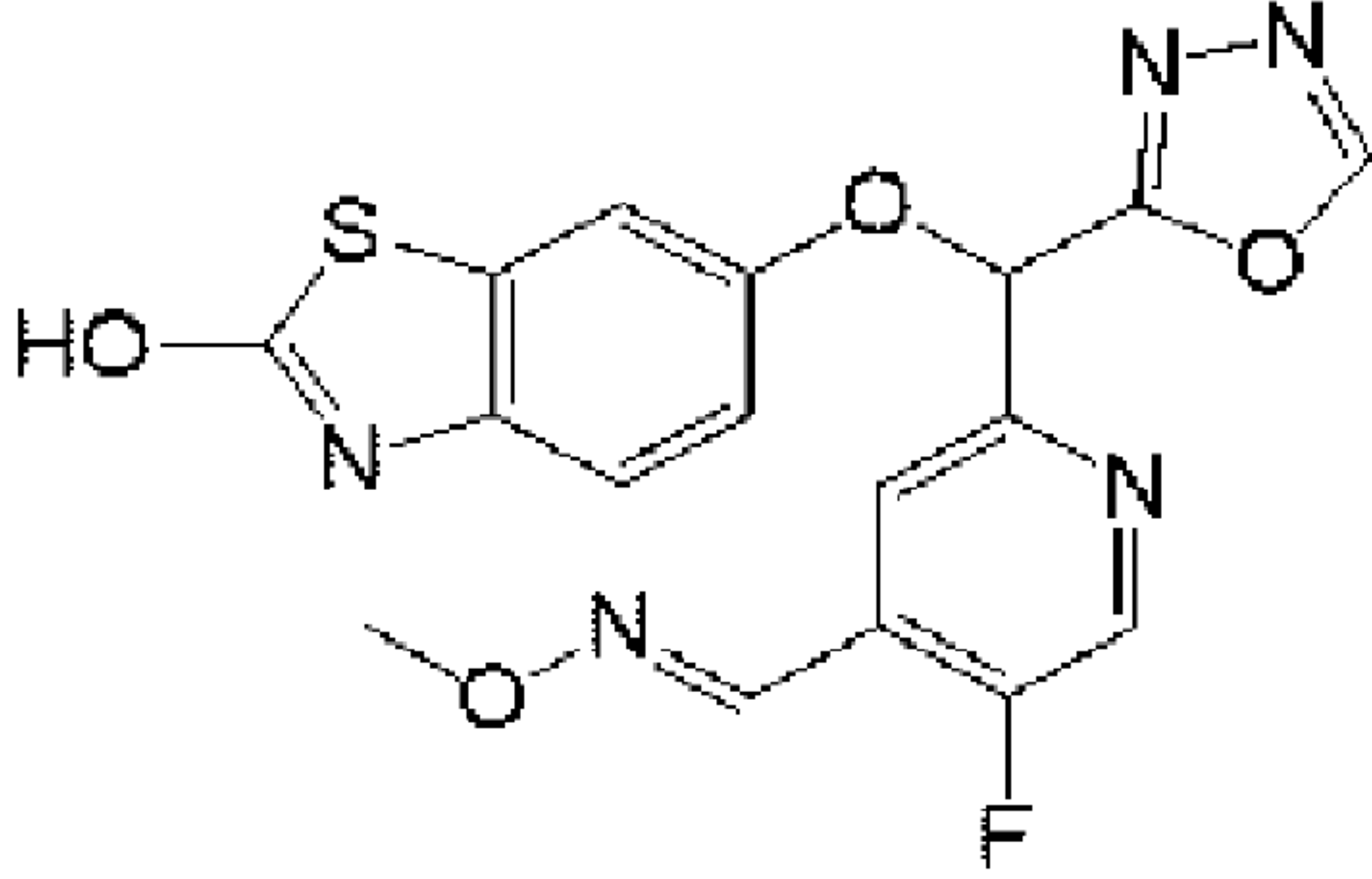
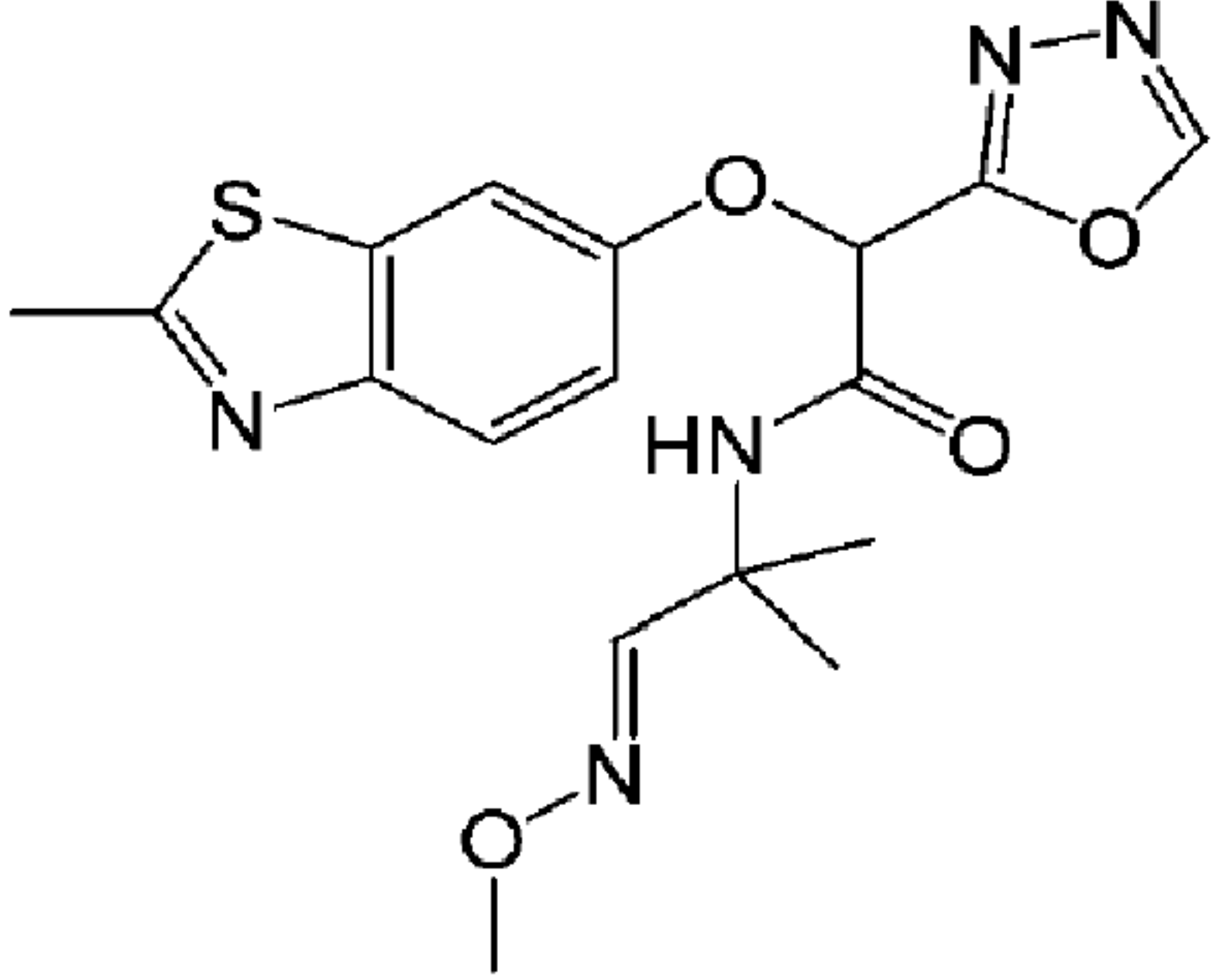
【0221】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-81		n _D (20.5°C) 1.6019
b-82		n _D (20.6°C) 1.5700
b-83		n _D (20.7°C) 1.5621
b-84		m.p. : 103-104°C
b-85		n _D (23.0°C) 1.5752

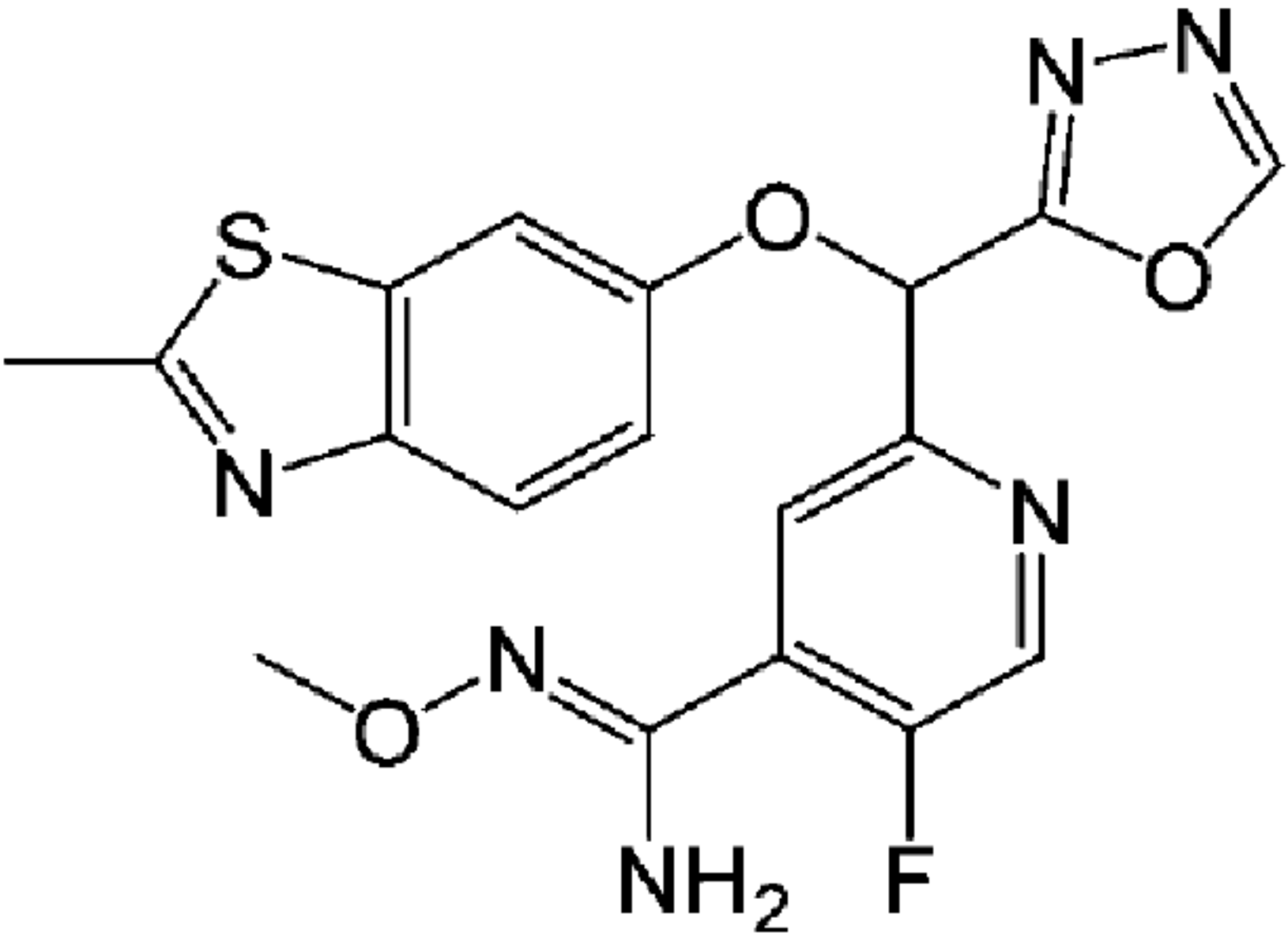
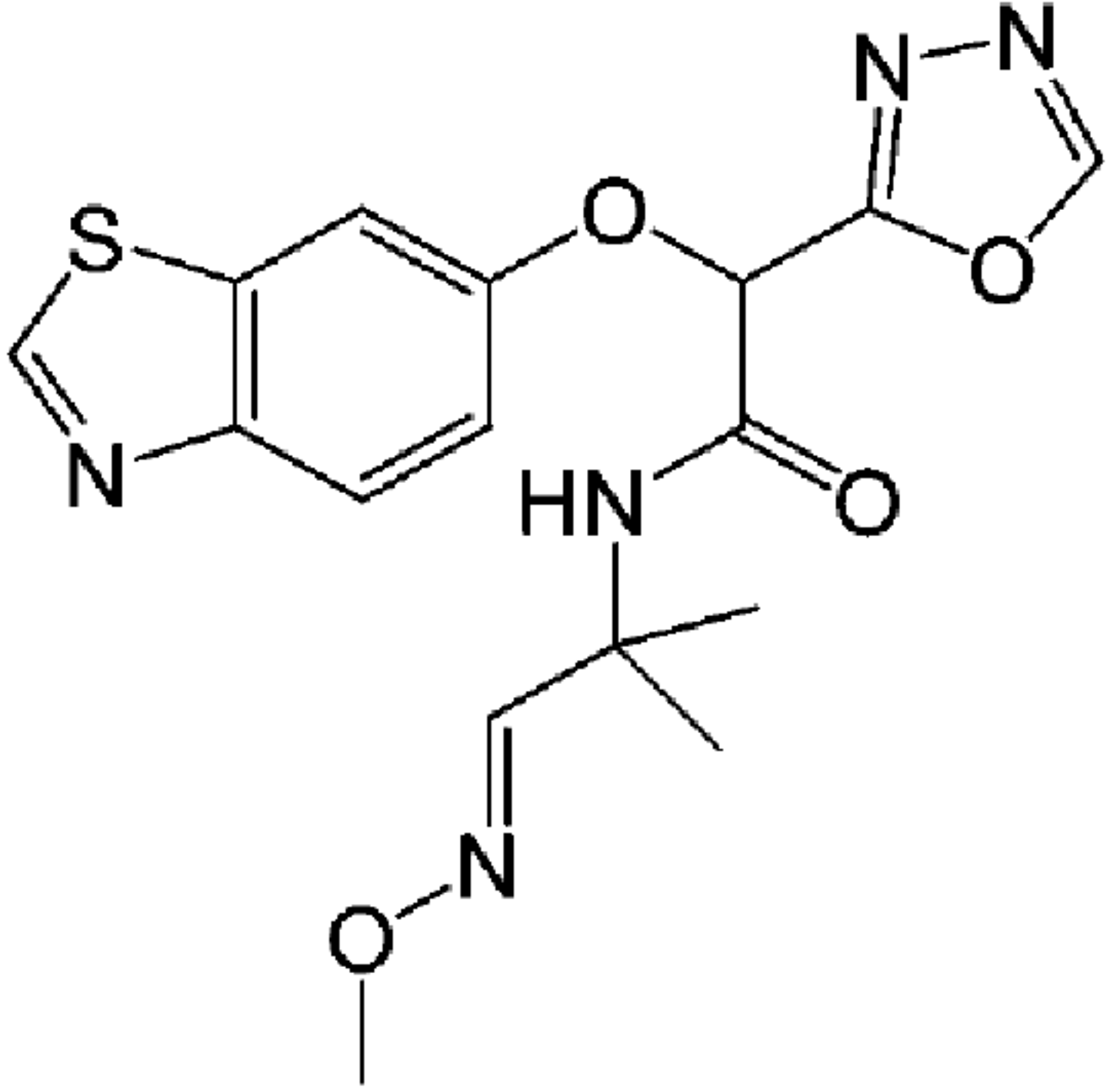
【0222】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-86		n_D (20.6°C) 1.5620
b-87		m.p. : 138-139°C
b-88		m.p. : 197-198°C
b-89		m.p. : 143-145°C

【0223】

表2（續）

化合物編號	結構	物性
b-90		m.p. : 116-121°C
b-91		m.p. : 129-130°C

【0224】 關於表1～表2中所示之化合物中之黏性油或非晶形之物性化合物，¹H-NMR資料如下所示。

化合物編號（a-1）：¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃)：δ 8.84 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.99 (d, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.18 (dd, 1H), 5.55 (dd, 1H), 2.20-2.31 (m, 1H), 2.01-2.13 (m, 1H), 1.50-1.61 (m, 1H), 1.31-1.46 (m, 3H), 0.92 (dd, 3H).

化合物編號（a-2）：¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃)：δ 8.37 (s, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.60 (dd, 2H), 7.33-7.47 (m, 4H), 7.15 (dd, 1H), 6.60 (s, 1H), 2.77 (s, 3H).

化合物編號（a-3）：¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃)：δ 8.37 (s, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.08 (dd, 1H), 5.51 (dd, 1H), 2.76 (s, 3H), 2.18-2.30 (m, 1H), 2.00-2.11 (m, 1H), 1.43-1.60 (m, 1H), 1.33-1.43 (m, 3H), 0.91 (dd, 3H).

化合物編號（a-4）：¹H-NMR(400 MHz, CDCl₃)：δ 8.87 (s, 1H), 8.41 (s, 1H),

8.02 (d, 1H), 7.62 (dd, 2H), 7.54 (d, 1H), 7.25 (dd, 1H), 7.08-7.19 (m, 2H), 6.63 (s, 1H).

化合物編號 (a-5) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.87 (s, 1H), 8.62 (dd, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.03 (d, 1H), 7.82 (dd, 2H), 7.60 (s, 1H), 7.21-7.38 (m, 2H), 6.76 (s, 1H).

化合物編號 (a-7) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.38 (s, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.13 (d, 1H), 5.51 (dd, 1H), 2.19-2.30 (m, 1H), 2.00-2.12 (m, 1H), 1.45-1.60 (m, 1H), 1.32-1.43 (m, 3H), 0.91 (dd, 3H).

化合物編號 (a-14) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.84 (s, 1H), 8.37 (s, 1H), 8.00 (d, 1H), 7.60 (dd, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.33-7.45 (m, 3H), 7.19-7.25 (m, 2H), 6.64 (s, 1H).

化合物編號 (a-15) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.88 (s, 1H), 8.80 (s, 2H), 8.50 (s, 1H), 8.03 (d, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.29 (dd, 1H), 6.87 (s, 1H).

化合物編號 (a-19) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.97 (s, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.41 (s, 1H), 7.82 (dd, 1H), 7.48-7.54 (m, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.08 (d, 1H), 6.72 (s, 1H), 2.72 (s, 3H).

化合物編號 (a-21) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.89 (s, 1H), 8.45 (d, 2H), 7.85 (dd, 1H), 7.76 (dd, 2H), 7.32-7.58 (m, 6H), 6.98 (s, 1H).

化合物編號 (a-24) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.87 (s, 1H), 8.43 (d, 2H), 7.85 (dd, 1H), 7.73 (dd, 2H), 7.48-7.59 (m, 2H), 7.31 (d, 1H), 7.01 (d, 2H), 6.78 (s, 1H), 3.85 (s, 3H).

化合物編號 (a-25) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.90 (s, 1H), 8.45 (d, 2H), 7.85 (dd, 1H), 7.73 (dd, 1H), 7.46-7.68 (m, 4H), 7.35 (s, 1H), 7.26 (d, 1H), 6.80 (s, 1H).

化合物編號 (a-31) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 6.95 (s, 1H), 7.38-7.45 (m,

2H), 7.46-7.53 (m, 2H), 7.60 (d, 1H), 7.74-7.81 (m, 2H), 8.50 (s, 1H), 8.71 (s, 2H), 8.91 (s, 1H).

化合物編號 (a-38) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.85 (s, 1H), 8.45 (d, 2H), 8.01 (d, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.61 (dd, 1H), 7.25 (dd, 2H), 6.69 (s, 1H), 2.49 (s, 3H).

化合物編號 (a-39) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.85 (s, 1H), 8.73 (d, 2H), 8.42 (s, 1H), 8.16 (dd, 1H), 7.97-8.05 (m, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.20-7.29 (m, 1H), 6.80 (s, 1H), 2.79 (s, 3H).

化合物編號 (a-42) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 10.58 (s, 1H), 9.03 (d, 1H), 8.85 (s, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.20 (dd, 1H), 8.02 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.60 (dd, 2H), 7.29 (dd, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.68 (s, 1H).

化合物編號 (a-53) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.87 (s, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.02 (d, 1H), 7.57 (dd, 2H), 7.24 (dd, 1H), 6.75 (s, 1H).

化合物編號 (a-57) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 6.79 (s, 1H), 7.28 (dd, 1H), 7.64 (d, 1H), 8.06 (d, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.66 (dd, 1H), 8.90 (d, 1H), 8.91 (s, 1H).

化合物編號 (a-58) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 2.62 (s, 3H), 6.80 (s, 1H), 7.29 (dd, 1H), 7.67 (d, 1H), 8.04 (d, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.89 (d, 1H), 8.97 (d, 1H).

化合物編號 (a-62) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.89 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.88 (s, 1H), 7.60 (d, 1H), 7.28 (dd, 1H), 6.71 (s, 1H), 4.40 (s, 2H), 3.84 (s, 3H).

化合物編號 (a-69) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 6.74 (s, 1H), 7.29 (dd, 1H), 7.51 (dd, 1H), 7.62 (d, 1H), 8.03 (d, 1H), 8.07 (s, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.89 (s, 1H).

化合物編號 (a-71) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 0.92 (t, 3H), 1.63-1.72 (m,

2H), 2.62 (t, 2H), 6.74 (s, 1H), 7.14 (dd, 1H), 7.28 (dd, 1H), 7.61 (d, 2H), 8.02 (d, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.87 (s, 1H).

化合物編號 (a-73) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 3.89 (s, 3H), 6.70 (s, 1H), 6.82 (dd, 1H), 7.28 (dd, 1H), 7.33 (d, 1H), 7.60 (d, 1H), 8.03 (d, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.87 (s, 1H).

化合物編號 (a-76) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 1.99 (s, 3H), 3.66 (s, 2H), 6.74 (s, 1H), 7.24-7.30 (m, 2H), 7.59 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 8.00 (d, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.85 (s, 1H).

化合物編號 (a-79) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 0.99 (t, 3H), 1.76-1.86 (m, 2H), 2.83 (t, 2H), 6.68 (s, 1H), 7.29-7.31 (m, 1H), 7.63 (m, 1H), 7.71 (s, 1H), 8.06 (d, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.90 (s, 1H), 9.11 (s, 1H).

化合物編號 (a-80) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 6.82 (s, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.46-7.52 (m, 3H), 7.55 (dd, 1H), 7.65-7.66 (m, 2H), 7.67 (m, 1H), 8.04 (d, 2H), 8.44 (s, 1H), 8.66-8.67 (m, 1H), 8.88 (s, 1H).

化合物編號 (a-83) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 6.85 (s, 1H), 7.34-7.39 (m, 2H), 7.66 (d, 1H), 7.82-7.86 (m, 2H), 7.95-7.97 (m, 1H), 8.04 (d, 1H), 8.44 (s, 2H), 8.73 (d, 1H), 8.74-8.77 (m, 1H), 8.87 (s, 1H).

化合物編號 (a-84) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 6.78 (s, 1H), 7.40-7.68 (m, 8H), 7.99 (s, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.65 (d, 1H), 8.92 (s, 1H).

化合物編號 (a-85) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 6.78 (s, 1H), 7.14-7.16 (m, 1H), 7.32-7.35 (m, 1H), 7.44-7.46 (m, 1H), 7.50-7.52 (m, 1H), 7.56-7.57 (m, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.99 (s, 1H), 8.05 (d, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.57-8.59 (m, 1H), 8.88 (s, 1H).

化合物編號 (a-86) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 6.84 (s, 1H), 7.33 (dd, 1H), 7.46-7.49 (m, 1H), 7.54-7.59 (m, 2H), 7.65-7.70 (m, 2H), 8.05-8.08 (m, 2H), 8.45 (s,

1H), 8.74-8.78 (m, 2H), 8.89 (s, 1H).

化合物編號 (a-88) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 1.35 (t, 3H), 3.15 (q, 2H), 6.80 (s, 1H), 7.15 (s, 1H), 7.38-7.57 (m, 6H), 7.64 (d, 1H), 8.02 (s, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.65 (d, 1H), 8.83 (s, 1H).

化合物編號 (a-90) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.87 (s, 1H), 8.62 (d, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.03 (d, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.44-7.40 (m, 1H), 7.33-7.29 (m, 1H), 6.78 (s, 1H), 5.44 (s, 1H), 3.33 (s, 3H), 3.31 (s, 3H).

化合物編號 (a-183) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.51 (1H, d), 8.47-8.47 (1H, m), 8.44 (1H, s), 7.91 (1H, d), 7.87-7.84 (2H, m), 7.50 (1H, d), 7.20 (1H, dd), 6.87 (1H, d), 6.75 (1H, s), 4.00 (3H, s), 2.79 (3H, s).

化合物編號 (a-188) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.88 (1H, s), 8.44 (1H, s), 8.37 (1H, d), 8.04 (1H, d), 7.75 (1H, d), 7.61 (1H, d), 7.30-7.27 (1H, m), 6.73 (1H, s), 3.64 (2H, td), 3.30 (3H, s), 2.98 (2H, t).

化合物編號 (a-189) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.42 (1H, s), 8.36 (1H, s), 7.77 (1H, d), 7.73 (1H, d), 7.45 (1H, d), 7.17 (1H, dd), 6.67 (1H, s), 3.64 (2H, td), 3.31 (3H, s), 2.97 (2H, t), 2.35-2.33 (1H, m), 1.22-1.18 (4H, m).

化合物編號 (a-190) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.88 (1H, s), 8.58 (1H, d), 8.43 (1H, s), 8.04 (1H, d), 7.80 (1H, s), 7.62 (1H, d), 7.33 (1H, d), 7.30 (1H, dd), 6.76 (1H, s), 4.74 (2H, s), 4.67 (2H, s), 4.03 (0H, d), 3.39 (3H, s).

化合物編號 (a-193) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.57 (1H, d), 8.41 (1H, s), 7.79 (1H, s), 7.32 (1H, d), 7.30 (1H, d), 7.05 (1H, d), 6.72 (1H, s), 4.74 (2H, s), 4.67 (2H, s), 3.39 (3H, s), 3.09 (2H, q), 2.79 (3H, s), 1.33 (3H, t).

化合物編號 (a-194) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.77 (1H, s), 8.59 (1H, d), 8.43 (1H, s), 7.78 (1H, s), 7.33 (1H, d), 7.13 (1H, d), 6.77 (1H, d), 6.76 (1H, s), 4.74

(2H, s), 4.67 (2H, s), 4.03 (3H, s), 3.39 (3H, s).

【0225】 化合物編號 (b-5) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.68 (d, 1H), 8.35 (s, 1H), 7.31-7.55 (m, 5H), 7.08 (d, 1H), 6.91 (dd, 1H), 5.95 (d, 1H), 5.05 (d, 1H).

化合物編號 (b-6) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 3.76 (s, 3H), 6.75 (s, 1H), 7.01 (d, 1H), 7.04-7.05 (m, 1H), 7.50-7.57 (m, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.85 (dd, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.45 (d, 1H).

化合物編號 (b-7) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 3.75 (s, 3H), 6.61 (s, 1H), 6.99 (s, 1H), 7.00 (d, 1H), 7.36-7.45 (m, 2H), 7.55 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.78 (s, 1H), 8.38 (s, 1H).

化合物編號 (b-8) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 3.76 (s, 3H), 6.72 (s, 1H), 6.76 (dd, 1H), 6.85 (d, 1H), 7.50-7.57 (m, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.82 (dd, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.45 (d, 1H).

化合物編號 (b-13) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 4.04 (s, 3H), 6.74 (s, 1H), 7.50-7.52 (m, 1H), 7.57 (dd, 2H), 7.95 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 8.44 (s, 1H), 8.61 (d, 1H), 8.95 (s, 1H).

化合物編號 (b-14) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 1.24 (t, 3H), 3.14 (q, 2H), 4.03 (s, 3H), 6.76 (s, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.49 (dd, 1H), 7.97 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.61 (d, 1H), 8.85 (s, 1H).

化合物編號 (b-18) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 1.25-1.35 (m, 6H), 4.45-4.53 (m, 1H), 6.75 (s, 1H), 7.29 (dd, 1H), 7.48 (d, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.93 (dd, 1H), 8.01 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.58 (d, 1H), 8.86 (s, 1H).

化合物編號 (b-20) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 2.51 (s, 1H), 4.81 (s, 2H), 6.76 (s, 1H), 7.28 (dd, 1H), 7.51 (d, 1H), 7.61 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.03 (d, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.42 (s, 1H), 8.62 (d, 1H), 8.87 (s, 1H).

化合物編號 (b-25) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 4.03 (s, 3H), 6.83 (s, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 8.03 (s, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.77 (d, 1H), 8.85 (s, 1H).

化合物編號 (b-28) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 4.01 (s, 3H), 4.14 (s, 3H), 6.66 (s, 1H), 7.10 (d, 1H), 7.33 (s, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.94 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.58 (d, 1H).

化合物編號 (b-29) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 1.42 (t, 3H), 3.07 (q, 2H), 4.01 (s, 3H), 6.71 (s, 1H), 7.19 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.83 (d, 1H), 7.93 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.58 (d, 1H).

化合物編號 (b-33) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 2.05 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 6.71 (s, 1H), 7.14 (dd, 1H), 7.31 (dd, 1H), 7.59-7.62 (m, 2H), 8.03 (d, 1H), 8.43-8.44 (m, 2H), 8.87 (s, 1H).

化合物編號 (b-34) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 1.55 (s, 9H), 4.01 (s, 3H), 6.71 (s, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.44 (s, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.59 (d, 1H).

化合物編號 (b-35) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 1.57 (s, 9H), 3.58 (s, 3H), 4.00 (s, 3H), 6.69 (s, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.94 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.56 (d, 1H).

化合物編號 (b-36) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 3.06 (s, 3H), 4.01 (s, 3H), 5.31 (br, 1H), 6.64 (s, 1H), 7.04 (d, 1H), 7.30 (s, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.46 (d, 1H), 7.95 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 8.40 (s, 1H), 8.57 (d, 1H).

化合物編號 (b-37) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 4.06 (s, 3H), 6.72 (s, 1H), 7.29 (d, 1H), 7.61 (s, 1H), 8.03 (d, 1H), 8.25 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 8.43 (s, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.87 (s, 1H).

化合物編號 (b-38) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.89 (1H, s), 8.59-8.58 (1H, m), 8.54 (1H, m), 8.45 (1H, s), 8.05 (1H, d), 7.62-7.61 (2H, m), 7.30-7.28 (1H, m), 6.76 (1H, s), 4.06 (3H, s).

化合物編號 (b-41) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.88 (1H, s), 8.54 (1H, s), 8.44 (1H, s), 8.43 (1H, s), 8.08 (1H, s), 8.04 (1H, d), 7.62 (1H, d), 7.31 (1H, dd), 6.73 (1H, s), 4.05 (3H, s), 2.53 (3H, s).

化合物編號 (b-49) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.89 (1H, s), 8.49-8.48 (1H, m), 8.44 (1H, s), 8.30 (1H, s), 8.22-8.21 (1H, m), 8.05 (1H, d), 7.63-7.62 (1H, m), 7.32-7.29 (1H, m), 6.75 (1H, s), 4.11-4.07 (2H, m), 1.26-1.19 (1H, m), 0.62-0.59 (2H, m), 0.36-0.32 (2H, m).

化合物編號 (b-51) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.69-8.66 (m, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.01-7.99 (m, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.68-7.62 (m, 2H), 7.58-7.55 (m, 1H), 7.53-7.42 (m, 4H), 6.88 (s, 1H).

化合物編號 (b-59) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.87 (1H, s), 8.45 (1H, s), 8.44 (1H, s), 8.25 (1H, d), 8.05 (1H, s), 8.02 (1H, d), 7.62 (1H, d), 7.32 (1H, dd), 6.73 (1H, s), 4.04 (3H, s), 2.41 (3H, s).

化合物編號 (b-67) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.89 (1H, s), 8.64 (1H, d), 8.46 (1H, s), 8.45 (1H, s), 8.17 (1H, s), 8.05 (1H, d), 7.95 (1H, s), 7.61 (1H, d), 7.51 (1H, dd), 7.31 (1H, dd), 6.77 (1H, s), 5.46 (2H, s).

化合物編號 (b-70) : $^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CDCl_3) : δ 8.88 (1H, s), 8.61 (1H, d), 8.45 (1H, s), 8.12 (1H, s), 8.04 (1H, d), 7.97 (1H, s), 7.63 (1H, d), 7.49 (1H, dd), 7.31 (1H, dd), 6.77 (1H, s), 4.42-4.36 (2H, m), 3.72-3.67 (2H, m), 3.41 (3H, s).

【0226】 [生物試驗]

於以下之試驗例中顯示出本發明化合物可用作農園藝用殺菌劑之有效成

分。

【0227】（試驗用乳劑之製備）

將本發明化合物5質量份、二甲基甲醯胺93.5質量份、及聚氧乙烯烷基芳基醚1.5質量份混合溶解，製備有效成分為5質量%之乳劑（I）。

【0228】防除值可藉由以下之公式算出。

防除值（%）=

$100 - \{ \text{處理區中之病斑面積率} / \text{未處理區中之病斑面積率} \} \times 100$

【0229】（試驗例1）蕃茄疫病防除試驗

於乳劑（I）中添加水以使雜環化合物濃度成為125質量ppm，使其溶解而獲得藥劑溶液。繼而，對育苗用罐中所栽培之蕃茄幼苗（品種「Regina」、4～5葉期）噴灑上述藥劑溶液。風乾後，對噴灑了藥劑溶液之蕃茄幼苗噴霧接種蕃茄疫病菌（*Phytophthora infestans*）之游走孢子囊懸浮液（處理區）。作為對照，與上述同樣地對未噴灑藥劑之蕃茄幼苗進行接種（未處理區）。將該等靜置於20℃之濕室。於接種後經過4天之日目視觀察蕃茄幼苗之葉，求出病斑面積率，算出防除值。

【0230】針對表3之化合物進行蕃茄疫病防除試驗。所有化合物均顯示出75%以上之防除值。

【0231】

表3								
a-1	a-35	a-61	a-88	a-115	a-145	a-172	b-20	b-55
a-2	a-36	a-62	a-89	a-116	a-146	a-173	b-21	b-56
a-3	a-37	a-63	a-90	a-117	a-147	a-174	b-22	b-57
a-4	a-38	a-64	a-91	a-120	a-148	a-175	b-23	b-58
a-5	a-39	a-65	a-93	a-121	a-149	a-177	b-24	b-63
a-8	a-40	a-66	a-94	a-122	a-150	a-178	b-25	b-66
a-9	a-43	a-67	a-95	a-123	a-151	a-179	b-26	b-67
a-10	a-44	a-68	a-96	a-124	a-152	a-180	b-27	b-68
a-13	a-45	a-69	a-97	a-125	a-153	a-181	b-29	b-69
a-14	a-46	a-70	a-98	a-127	a-154	a-182	b-33	b-70
a-15	a-47	a-71	a-99	a-128	a-155	b-3	b-36	b-71
a-16	a-48	a-73	a-100	a-129	a-157	b-4	b-37	b-74
a-17	a-49	a-74	a-101	a-130	a-158	b-5	b-38	b-76
a-18	a-50	a-75	a-102	a-132	a-159	b-6	b-39	b-78
a-19	a-51	a-76	a-103	a-133	a-160	b-7	b-40	b-79
a-20	a-52	a-78	a-104	a-134	a-161	b-8	b-42	b-84
a-21	a-53	a-79	a-105	a-135	a-162	b-9	b-44	b-85
a-22	a-54	a-80	a-107	a-137	a-163	b-10	b-45	b-86
a-23	a-55	a-81	a-108	a-138	a-165	b-12	b-46	b-87
a-28	a-56	a-83	a-110	a-139	a-166	b-13	b-47	
a-31	a-57	a-84	a-111	a-141	a-167	b-14	b-48	
a-32	a-58	a-85	a-112	a-142	a-168	b-15	b-49	
a-33	a-59	a-86	a-113	a-143	a-170	b-17	b-50	
a-34	a-60	a-87	a-114	a-144	a-171	b-18	b-51	

【0232】 （試驗例2）葡萄露菌病防除試驗

於乳劑（I）中添加水以使雜環化合物濃度成為100質量ppm，使其溶解而獲得藥劑溶液。繼而，對置於6孔板內之瓊脂上之葡萄(品種「霞多麗(Chardonnay)）」葉盤（leaf disc）噴灑上述藥劑溶液。風乾後，對噴灑了藥劑溶液之葡萄葉盤噴霧接種葡萄露菌病菌（*Plasmopara viticola*）之游走孢子囊懸浮液（處理區）。作為對照，與上述同樣地對未噴灑藥劑之葡萄葉盤進行接種（未處理區）。將該等靜置於20℃之濕室。於接種後經過7天之日目視觀察葡萄葉盤，求出病斑面積率，算出防除值。

【0233】 針對表4之化合物進行葡萄露菌病防除試驗。所有化合物均顯示

出75%以上之防除值。

【0234】

表4								
a-4	a-48	a-75	a-103	a-133	a-160	b-14	b-44	b-74
a-5	a-49	a-76	a-105	a-134	a-161	b-15	b-45	b-76
a-8	a-50	a-78	a-107	a-135	a-162	b-16	b-46	b-77
a-9	a-51	a-80	a-108	a-136	a-163	b-17	b-47	b-81
a-15	a-52	a-81	a-110	a-137	a-165	b-18	b-48	b-83
a-16	a-53	a-84	a-111	a-138	a-166	b-19	b-49	b-84
a-17	a-54	a-85	a-112	a-139	a-168	b-20	b-50	b-85
a-19	a-55	a-86	a-114	a-140	a-169	b-21	b-51	b-86
a-20	a-56	a-87	a-115	a-141	a-170	b-22	b-52	b-87
a-21	a-57	a-88	a-116	a-142	a-171	b-23	b-53	
a-22	a-58	a-89	a-117	a-143	a-172	b-24	b-54	
a-23	a-60	a-90	a-118	a-144	a-173	b-26	b-55	
a-27	a-61	a-91	a-120	a-145	a-175	b-27	b-56	
a-28	a-62	a-92	a-121	a-146	a-177	b-28	b-57	
a-31	a-63	a-93	a-122	a-147	a-178	b-29	b-58	
a-32	a-64	a-94	a-123	a-148	a-179	b-33	b-59	
a-33	a-65	a-95	a-124	a-150	a-180	b-36	b-63	
a-35	a-66	a-96	a-125	a-151	a-181	b-37	b-66	
a-38	a-68	a-97	a-127	a-152	a-182	b-38	b-67	
a-41	a-69	a-98	a-128	a-154	a-183	b-39	b-68	
a-44	a-70	a-99	a-129	a-155	b-9	b-40	b-69	
a-45	a-71	a-100	a-130	a-157	b-10	b-41	b-70	
a-46	a-72	a-101	a-131	a-158	b-12	b-42	b-71	
a-47	a-74	a-102	a-132	a-159	b-13	b-43	b-72	

【0235】 從本發明化合物中隨機選擇者發揮上述效果，因此可以理解為本發明化合物包括未例示之化合物在內，具有殺菌效果，對植物體不產生藥害，對人畜魚類之毒性或對環境之影響小。

[產業上之可利用性]

【0236】

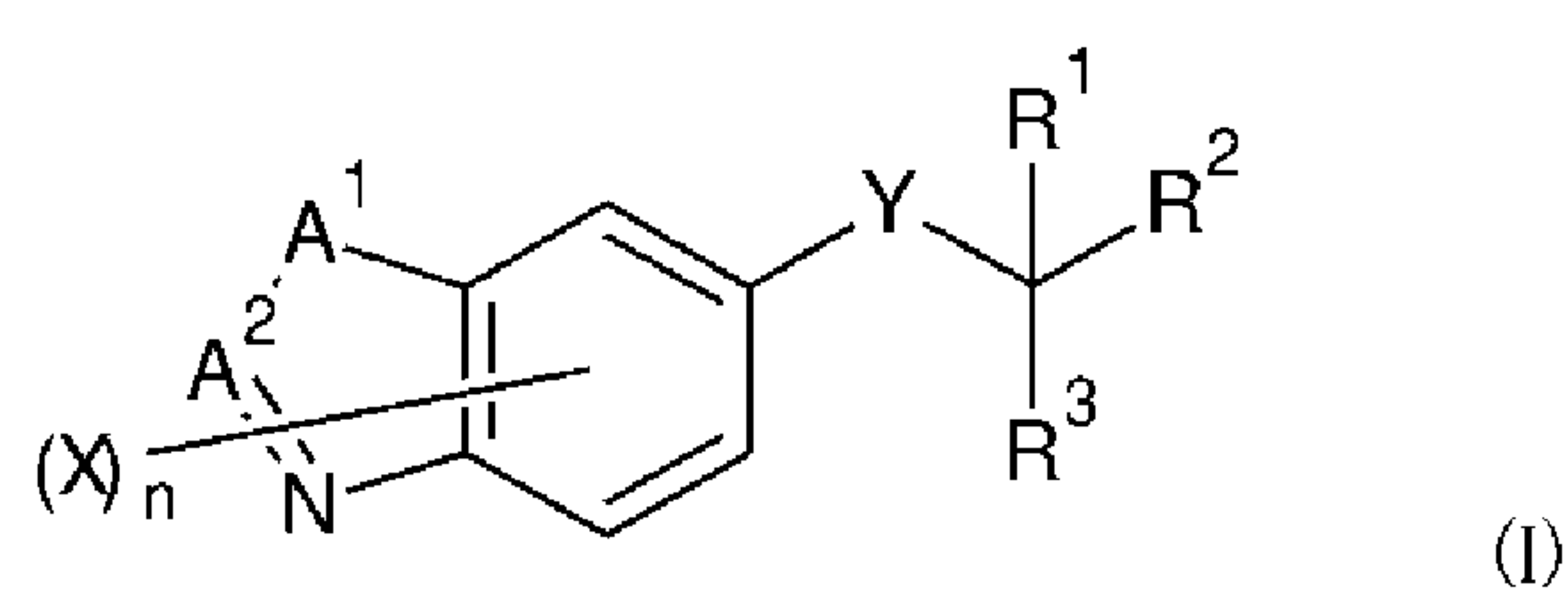
本發明之雜環化合物及其鹽之殺菌活性優異，效果可靠，安全性優異，且能夠於工業上有利地合成。本發明之農園藝用殺菌劑具有優異之防除效果，對植物體不產生藥害，對人畜魚類之毒性及對環境之影響小。

【符號說明】

無

【發明申請專利範圍】

【請求項1】一種式（I）所表示之化合物或其鹽，



式（I）中，

R¹為氫原子、經取代或未經取代之C1-6烷基、或鹵素基，

R²為經取代或未經取代之5～6員雜芳基，

R³為經取代或未經取代之C1-6烷基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基羰基、
經取代或未經取代之C1-6烷硫基（alkylthio）、經取代或未經取代之C6-10芳基、
經取代或未經取代之5～6員雜芳基、式-C(Rⁱ)=NOR^j所表示之基、或式-
C(=O)NHR^s所表示之基，

Rⁱ為氫原子或C1-6烷基，

R^j為經取代或未經取代之C1-6烷基，

R^s為經取代或未經取代之C1-6烷基，

Y為氧原子或NH，

A¹為硫原子、氧原子、或NR⁴，

R⁴為C1-6烷基，

A²為碳原子、或氮原子，

X為取代基，

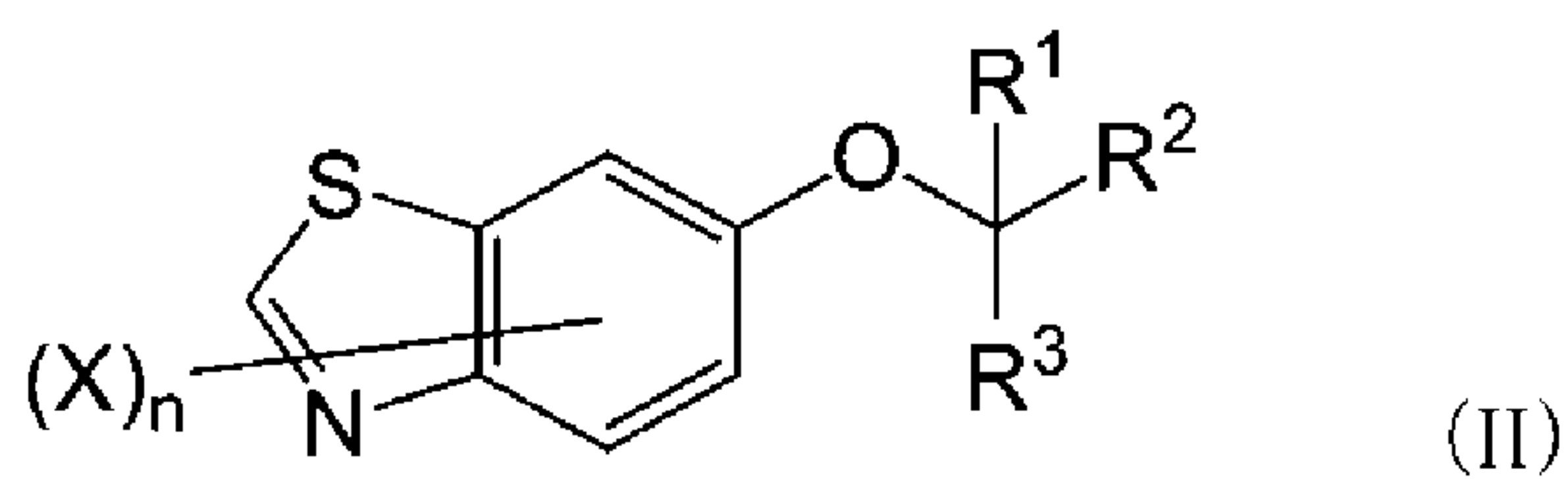
n表示化學上容許之X之個數，且為0～3之任意整數，且

於n為2以上時，X可相互相同亦可不同。

【請求項2】如請求項1之化合物或其鹽，其中，於式（I）中，X為經取代或

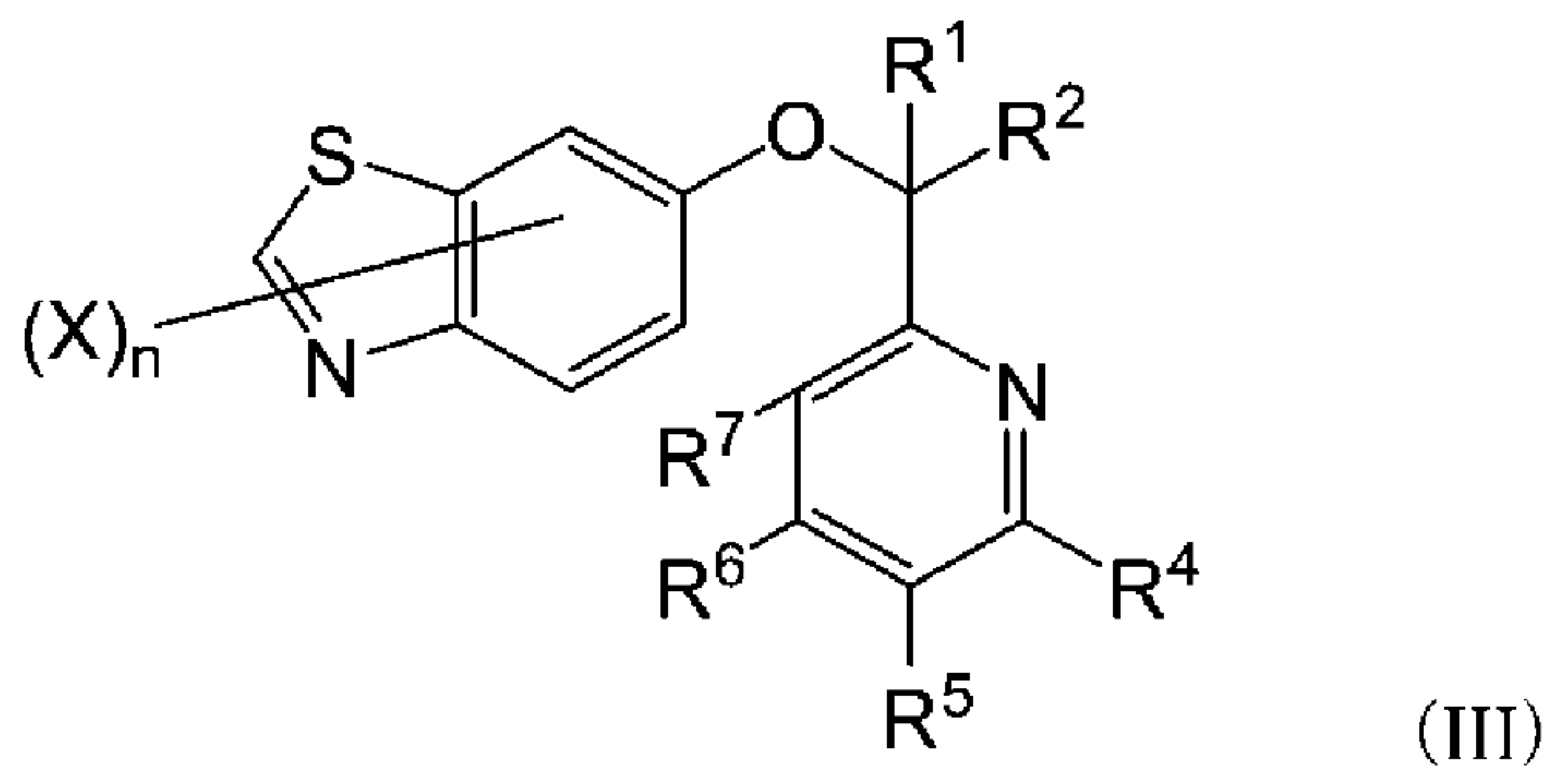
未經取代之C1-6烷基、經取代或未經取代之C2-6烯基、經取代或未經取代之C2-6炔基、羥基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基羰基、經取代或未經取代之C1-6烷硫基、經取代或未經取代之C3-8環烷基、經取代或未經取代之C6-10芳基、鹵素基、氰基、式-NR^aR^b所表示之基（式中，R^a及R^b各自獨立地為氫原子、C1-6烷基、或C1-6烷氧基羰基）、或式-C(R^e)=NOR^f所表示之基（式中，R^e及R^f各自獨立地為氫原子、或C1-6烷基）。

【請求項3】如請求項1之化合物或其鹽，其中，式（I）為式（II）：



式（II）中，R¹、R²、R³、X及n表示與式（I）中之該等相同之含義。

【請求項4】如請求項1之化合物或其鹽，其中，式（I）為式（III）：



式（III）中，

R¹、R²、X及n表示與式（I）中之該等相同之含義，

R⁴、R⁵、R⁶及R⁷各自獨立地為氫原子、經取代或未經取代之C1-6烷基、經取代或未經取代之C2-6烯基、經取代或未經取代之C2-6炔基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基、經取代或未經取代之C1-6烷氧基羰基、經取代或未經取代之C1-6烷硫基、經取代或未經取代之C1-6烷基亞磺醯基、經取代或未經取代之C1-6烷基磺

醯基、經取代或未經取代之C6-10芳基、經取代或未經取代之5~6員雜環基、鹵素基、氰基、硝基、式- $C(R^g)=NOR^h$ （式中， R^g 為氫原子、C1-6烷基、或胺基， R^h 為氫原子、經取代或未經取代之C1-6烷基、或C2-6炔基）所表示之基、式-O-N= CR^cR^d （式中， R^c 及 R^d 各自獨立地為氫原子、或C1-6烷基）所表示之基、或式-C(=O)NR^pR^q（ R^p 及 R^q 各自獨立地為氫原子或C1-6烷基）。

【請求項5】一種農園藝用殺菌劑，其含有選自由請求項1至4之化合物及該等之鹽所組成之群之至少一種作為有效成分。