

發明專利說明書

200417319

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：92132750

※申請日期：92-11-21

※IPC 分類：A01N43/42

壹、發明名稱：(中文/英文)

殺真菌劑

FUNGICIDES

貳、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

英商辛堅塔股份有限公司

SYNGENTA LIMITED

代表人：(中文/英文)

瑪格莉特 安 魯德

MARGARET ANN RUDD

住居所或營業所地址：(中文/英文)

英國雪瑞郡古爾佛德市普利斯利路雪瑞研究公園

EUROPEAN REGIONAL CENTRE, PRIESTLEY ROAD, SURREY

RESEARCH PARK GUILDFORD SURREY GU2 7YH UNITED

KINGDOM

國 籍：(中文/英文)

英國 UNITED KINGDOM

參、發明人：(共 2 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 派屈克 傑夫 克勞力
PATRICK JELF CROWLEY
2. 羅傑 莎曼
ROGER SALMON

住居所地址：(中文/英文)

1. 英國柏克夏郡布萊克尼爾市吉洛特崗國際研究中心辛堅塔股份有限公司
SYNGENTA LIMITED, JEALOTT'S HILL INTERNATIONAL
RESEARCH CENTRE, BRACKNELL, BERKS RG42 6EY, U.K.
2. 英國柏克夏郡布萊克尼爾市吉洛特崗國際研究中心辛堅塔股份有限公司
SYNGENTA LIMITED, JEALOTT'S HILL INTERNATIONAL
RESEARCH CENTRE, BRACKNELL, BERKS RG42 6EY, U.K.

國 籍：(中文/英文)

1. 英國 UNITED KINGDOM
2. 英國 UNITED KINGDOM

肆、聲明事項：

☐ 本案係符合專利法第二十條第一項 ☐ 第一款但書或 ☐ 第二款但書規定之期間，其日期為： 年 月 日。

☒ 本案申請前已向下列國家（地區）申請專利：

1. 英國 2002/11/26 0227555.0

2.

3.

4.

5.

☒ 主張國際優先權(專利法第二十四條)：

【格式請依：受理國家（地區）；申請日；申請案號數 順序註記】

1. 英國 2002/11/26 0227555.0

2.

3.

4.

5.

☐ 主張國內優先權(專利法第二十五條之一)：

【格式請依：申請日；申請案號數 順序註記】

1.

2.

☐ 主張專利法第二十六條微生物：

☐ 國內微生物 【格式請依：寄存機構；日期；號碼 順序註記】

☐ 國外微生物 【格式請依：寄存國名；機構；日期；號碼 順序註記】

☐ 熟習該項技術者易於獲得，不須寄存。

玖、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

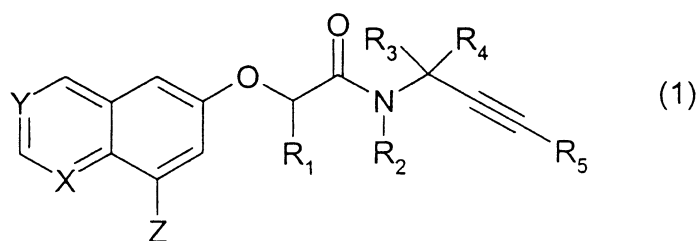
本發明係關於新穎 N-炔基 -2-噻啉 -(異噻啉 -與噻啉-) 氧基烷基醯胺類，製備彼等之方法，含有彼等之組合物，及使用彼等以撲滅真菌，尤其是植物之真菌感染之方法。

【先前技術】

各種噻啉 -8-氧基烷羧酸衍生物係被描述為可作為除草劑之解毒藥或作為除草安全劑使用 (參閱，例如 US 4,881,966、US 4,902,340 及 US 5,380,852)。某些雜芳基氧基(硫基)烷羧酸醯胺衍生物係被描述於例如 WO 99/33810、US 6090815 及 JP 2001089453 中，伴隨著其作為農業與園藝殺真菌劑之用途。此外，某些苯氧基烷羧酸醯胺衍生物係被描述於例如 US 4116677 與 US 4168319 中，伴隨著其作為除草劑與殺霉菌劑之用途。

【發明內容】

根據本發明，係提供通式 (1) 化合物：



其中

X 與 Y 之一為 N 或 N-氧化物，而另一個為 CR，或 X 與 Y 兩個均為 N；

Z 為 H，鹵基 (例如氟基、氯基、溴基或碘基)，C₁₋₆ 烷基，視情況被鹵基或 C₁₋₄ 烷氧基取代，C₃₋₆ 環烷基，視情況被鹵

基或 C_{1-4} 烷氧基取代， C_{2-4} 烯基，視情況被鹵基取代， C_{2-4} 炔基，視情況被鹵基取代， C_{1-6} 烷氧基，視情況被鹵基或 C_{1-4} 烷氧基取代， C_{2-4} 烯氧基，視情況被鹵基取代(例如烯丙氧基)， C_{2-4} 炔氧基，視情況被鹵基取代(例如炔丙基氧基)，
 氰基、硝基、 C_{1-4} 烷氧羰基、 $-\text{OSO}_2\text{R}'$ 、 $\text{S}(\text{O})_n\text{R}'$ 、 $-\text{COR}''$ 、 $-\text{CONR}''\text{R}'''$ 、 $-\text{CR}''=\text{NOR}'$ 、 $\text{NR}''\text{R}'''$ 、 $\text{NR}''\text{COR}'$ 、 $\text{NR}''\text{CO}_2\text{R}'$ ，其中 n 為 0, 1 或 2，
 R' 為 C_{1-6} 烷基，視情況被鹵素取代，且 R'' 與 R''' 係獨立為 H 或 C_{1-6} 烷基，或在 $-\text{CONR}''\text{R}'''$ 之情況中，可接合而形成 5- 或 6- 員環，含有單一氮原子、飽和碳原子及選用之單一氧原子；
 R 為 H、鹵基、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{2-8} 烯基、 C_{2-8} 炔基、 C_{1-8} 烷氧基、 C_{1-8} 烷硫基、硝基、胺基、單-或二- (C_{1-6}) 烷胺基、單-或二- (C_{2-6}) 烯基胺基、單-或二- (C_{2-6}) 炔基胺基、
 甲醯胺基、 C_{1-4} 烷基(甲醯基)胺基、 C_{1-4} 烷基-羰基胺基、 C_{1-4} 烷氧羰基胺基、 C_{1-4} 烷基(C_{1-4} 烷羰基)胺基、氰基、甲醯基、 C_{1-4} 烷羰基、 C_{1-4} 烷氧羰基、胺基羰基、單-或二- (C_{1-4}) 烷基-胺基羰基、羧基、 C_{1-4} 烷羰基氧基、芳基($C_{1-4})$ 烷羰基氧基、 C_{1-4} 烷基-亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基或 C_{1-4} 烷基磺醯基氧基；

R_1 為 C_{1-4} 烷基、 C_{2-4} 烯基或 C_{2-4} 炔基，其中烷基、烯基及炔基係視情況在其末端碳原子上被一、二或三個鹵原子(例如 2,2,2-三氟乙基)，被氰基(例如氰基甲基)，被 C_{1-4} 烷羰基(例如乙醯基甲基)，被 C_{1-4} 烷氧羰基(例如甲氧羰基甲基與甲氧羰基乙基)，或被羥基(例如羥甲基)取代，或

R_1 為烷氧烷基、烷基硫基烷基、烷基亞磺醯基烷基或烷基

磺醯基烷基，其中碳原子總數為2或3(例如甲氧基甲基、甲硫基甲基、乙氧基甲基、2-甲氧基乙基及2-甲硫基乙基)，或

R_1 為直鏈 C_{1-4} 烷氧基(意即甲氧基、乙氧基、正-丙氧基及正-丁氧基)；

R_2 為 H、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基甲基或苄氧基甲基，其中苄基部份基團之苯環係視情況被 C_{1-4} 烷氧基取代；

R_3 與 R_4 係獨立為 H、 C_{1-3} 烷基、 C_{2-3} 烯基或 C_{2-3} 炔基，其條件是，兩者不同時為 H，且當兩者為 H 以外者時，其合併之碳原子總數不超過4，或

R_3 與 R_4 和彼等所連接之碳原子一起接合，以形成3或4員碳環，視情況含有一個 O、S 或 N 原子，且視情況被鹵基或 C_{1-4} 烷基取代；及

R_5 為 H、 C_{1-4} 烷基或 C_{3-6} 環烷基，其中烷基或環烷基係視情況被以下基團取代，鹵基、羥基、 C_{1-6} 烷氧基、氰基、 C_{1-4} 烷羰基氧基、胺基-羰基氧基、單-或二(C_{1-4})烷胺基羰基氧基、 $-S(O)_n(C_{1-6})$ 烷基，其中 n 為 0, 1 或 2，三唑基(例如 1,2,4-三唑-1-基)、三(C_{1-4})烷基矽烷基氧基、視情況經取代之苯氧基、視情況經取代之噻吩基氧基、視情況經取代之苄氧基或視情況經取代之噻吩基甲氧基，或

R_5 為視情況經取代之苯基、視情況經取代之噻吩基或視情況經取代之苄基，

其中 R_5 意義之視情況經取代之苯基與噻吩基環係視情況被一、二或三個取代基取代，選自鹵基、羥基、巰基、 C_{1-4} 烷

基、 C_{2-4} 、烯基、 C_{2-4} 炔基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{2-4} 烯氧基、 C_{2-4} 炔氧基、鹵基(C_{1-4})烷基、鹵基(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、鹵基(C_{1-4})烷硫基、羥基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯氧基、苄氧基、苯甲醯氧基、氰基、異氰基、氰硫基、異硫氰基、硝基、 $-NR^mR^n$ 、 $-NHCOR^m$ 、 $-NHCONR^mR^n$ 、 $-CONR^mR^n$ 、 $-SO_2R^m$ 、 $-OSO_2R^m$ 、 $-COR^m$ 、 $-CR^m=NR^n$ 或 $-N=CR^mR^n$ ，其中 R^m 與 R^n 係獨立為氫、 C_{1-4} 烷基、鹵基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基、鹵基(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯基或苄基，該苯基與苄基係視情況被鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代。

本發明化合物含有至少一個不對稱碳原子(而當 R_3 與 R_4 不同時，為至少兩個)，且可以對掌異構物(或以非對映異構物對)或以其混合物存在。但是，此等混合物可被分離成個別異構物或異構物對，且本發明係包含此種異構物及其呈所有比例之混合物。對任何特定化合物而言，預期一種異構物可比另一種較具殺真菌活性。

除非其中另有述及，否則烷基及烷氧基、烷硫基等之烷基部份基團係適當地含有1至4個呈直鏈或分枝鏈形式之碳原子。實例為甲基、乙基、正-與異-丙基，及正-、第二-、異-及第三-丁基。在烷基部份基團含有5或6個碳原子之情況下，實例為正-戊基與正-己基。

烯基與炔基部份基團亦適當地含有2至4個呈直鏈或分枝鏈形式之碳原子。實例為烯丙基、乙炔基及炔丙基。

鹵基包括氟基、氯基、溴基及碘基。其最常為氟基、氯基

或溴基，而經常為氟基或氯基。

特別令人感興趣的是，通式(1)化合物，其中X為N，且Y為CR(喹啉類)。亦令人感興趣的是以下之化合物，其中X與Y均為N(喹啉)，及其中Y為N，且X為CR(異喹啉類)。

R典型上為H、鹵基(例如氯基或溴基)或氟基。

Z典型上為H或鹵基(例如溴基)。

R₁典型上為甲基、乙基、正-丙基、2,2,2-三氟甲基、氟基甲基、乙醯基甲基、甲氧羰基甲基、甲氧羰基乙基、羥甲基、羥基-乙基、甲氧基甲基、甲硫基甲基、乙氧基甲基、2-甲氧基乙基、2-甲硫基-乙基、甲氧基、乙氧基、正-丙氧基或正-丁氧基。乙基為R₁之較佳意義，而亦特別令人感興趣的是甲氧基、乙氧基及甲氧基甲基。

R₂典型上為H，且至少一個，但較佳為R₃與R₄兩者均為甲基。

當R₃與R₄之一為H時，另一個可為甲基、乙基或正-或異丙基。當R₃與R₄之一為甲基時，另一個可為H或乙基，但較佳亦為甲基。R₂亦包括C₁₋₄烷氧基甲基與苄氧基甲基，其中苄基之苯環係視情況帶有烷氧基取代基，例如甲氧基取代基。R₂之此種意義係提供式(1)化合物，咸認其係為預殺害化合物。

R₅典型上為H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、第三-丁基二甲基矽烷氧基甲基、3-氟基丙基、3-甲氧基丙基、3-(1,2,4-三唑-1-基)-丙基、3-甲硫基丙基、3-甲烷亞磺醯基丙基或3-甲烷磺醯基丙基。特別令人感興趣的是其中

R_5 為甲基、甲氧基甲基或氰基丙基之化合物。

於一方面，本發明係提供通式(1)化合物，其中 $X, Y, Z, R_1, R_2, R_3, R_4$ 及 R_5 均如上文定義，惟 R_5 不為 H。

於另一方面，本發明係提供通式(1)化合物，其中 X 與 Y 之一為 N，而另一個為 CR，或 X 與 Y 兩個均為 N；
 Z 為 H；

R 為 H、鹵基、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{2-8} 烯基、 C_{2-8} 炔基、 C_{1-8} 烷氧基、 C_{1-8} 烷硫基、硝基、胺基、單-或二- (C_{1-6}) 烷胺基、單-或二- (C_{2-6}) 烯基胺基、單-或二- (C_{2-6}) 炔基胺基、甲醯胺基、 C_{1-4} 烷基(甲醯基)胺基、 C_{1-4} 烷基-羰基胺基、 C_{1-4} 烷基(C_{1-4} 烷羰基)胺基、氰基、甲醯基、 C_{1-4} 烷羰基、 C_{1-4} 烷氧羰基、胺基羰基、單-或二- (C_{1-4}) 烷胺基羰基、羧基、 C_{1-4} 烷羰基氧基、芳基(C_{1-4})烷羰基氧基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基或 C_{1-4} 烷基磺醯基氧基；

R_1 為 C_{1-4} 烷基、 C_{2-4} 烯基或 C_{2-4} 炔基，其中烷基、烯基及炔基係視情況在其末端碳原子上被一、二或三個鹵原子，被氰基，被 C_{1-4} 烷羰基，被 C_{1-4} 烷氧羰基，或被羥基取代，或 R_1 為烷氧烷基、烷基硫基烷基、烷基亞磺醯基烷基或烷基磺醯基烷基，其中碳原子總數為 2 或 3，或

R_1 為直鏈 C_{1-4} 烷氧基；

R_2 為 H、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基甲基或苄氧基甲基，其中苄基部份基團之苯環係視情況被 C_{1-4} 烷氧基取代；

R_3 與 R_4 係獨立為 H、 C_{1-3} 烷基、 C_{2-3} 烯基或 C_{2-3} 炔基，其條件是，兩者不同時為 H，且當兩者為 H 以外者時，其合併之碳

原子總數不超過4，或

R_3 與 R_4 和彼等所連接之碳原子一起接合，以形成3或4員碳環，視情況含有一個O、S或N原子，且視情況被鹵基或 C_{1-4} 烷基取代；及

R_5 為H、 C_{1-4} 烷基或 C_{3-6} 環烷基，其中烷基或環烷基係視情況被鹵基、羥基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 烷硫基、氰基、 C_{1-4} 烷基羰基氧基、胺基羰基氧基或單-或二(C_{1-4})烷胺基羰基氧基、三(C_{1-4})烷基矽烷基氧基、視情況經取代之苯氧基、視情況經取代之噻吩基氧基、視情況經取代之苄氧基或視情況經取代之噻吩基甲氧基取代，或

R_5 為視情況經取代之苯基、視情況經取代之噻吩基或視情況經取代之苄基，

其中 R_5 意義之視情況經取代之苯基與噻吩基環係視情況被一、二或三個取代基取代，選自鹵基、羥基、巰基、 C_{1-4} 烷基、 C_{2-4} 、烯基、 C_{2-4} 炔基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{2-4} 烯氧基、 C_{2-4} 炔氧基、鹵基(C_{1-4})烷基、鹵基(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、鹵基(C_{1-4})烷硫基、羥基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯氧基、苄氧基、苯甲醯氧基、氰基、異氰基、氰硫基、異硫氰基、硝基、 $-NR^mR^n$ 、 $-NHCOR^m$ 、 $-NHCONR^mR^n$ 、 $-CONR^mR^n$ 、 $-SO_2R^m$ 、 $-OSO_2R^m$ 、 $-COR^m$ 、 $-CR^m=NR^n$ 或 $-N=CR^mR^n$ ，其中 R^m 與 R^n 係獨立為氫、 C_{1-4} 烷基、鹵基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基、鹵基(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯基或苄基，該苯基與苄基係視情況被鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取

代。

於另一方面，本發明係提供通式(1)化合物，其中X與Y之一為N，而另一個為CR，或X與Y兩者均為N；Z為H；R為H、鹵基或氰基， R_1 為甲基、乙基、正-丙基、2,2,2-三氟甲基、氰基甲基、乙醯基甲基、甲氧羰基甲基、甲氧羰基乙基、羥甲基、羥乙基、甲氧基甲基、甲硫基甲基、乙氧基甲基、2-甲氧基乙基、甲氧基、乙氧基、正-丙氧基、正-丁氧基； R_2 為H； R_3 與 R_4 均為甲基；及 R_5 為H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、第三-丁基二甲基-矽烷氧基甲基、3-氰基丙基、3-甲氧基丙基、3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基、3-甲基-硫基丙基、3-甲烷亞磺醯基丙基或3-甲烷磺醯基丙基。 R_1 較佳為乙基、甲氧基、乙氧基或甲氧基甲基，尤其是乙基。 R_5 較佳為甲基、甲氧基甲基或3-氰基丙基。

構成本發明一部份之化合物，係示於下文表1至152中。

表1中之化合物具有通式(1)，其中X為N，Y為CH，Z為H， R_1 為乙基， R_2 為H， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表中所予之意義。

表1

化合物編號	R_5
1	H
2	CH ₃
3	C ₂ H ₅
4	正-C ₃ H ₇
5	異-C ₃ H ₇
6	正-C ₄ H ₉
7	第二-C ₄ H ₉

8	異 -C ₄ H ₉
9	第 三 -C ₄ H ₉
10	HOCH ₂
11	HOC ₂ H ₄
12	CH ₃ OCH ₂
13	CH ₃ OCH ₂ CH ₂
14	C ₂ H ₅ OCH ₂
15	CH ₃ (CH ₃ O)CH
16	正 -C ₃ H ₇ OCH ₂
17	正 -C ₃ H ₇ OC ₂ H ₄
18	第 三 -C ₄ H ₉ OCH ₂
19	第 三 -C ₄ H ₉ OC ₂ H ₄
20	CH ₃ SCH ₂
21	CH ₃ SC ₂ H ₄
22	C ₂ H ₅ SCH ₂
23	C ₂ H ₅ SC ₂ H ₄
24	正 -C ₃ H ₇ SCH ₂
25	正 -C ₄ H ₉ SCH ₂
26	C ₆ H ₅ OCH ₂
27	C ₆ H ₅ OC ₂ H ₄
28	4-第 三 -C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄ OCH ₂
29	4-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
30	4-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
31	4-CH ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
32	4-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
33	2-F-C ₆ H ₄ OCH ₂
34	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
35	3-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
36	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃ OCH ₂
37	4-CF ₃ O-C ₆ H ₅ OCH ₂
38	2-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂

39	4-CF ₃ -C ₆ H ₄ OCH ₂
40	2-Br-C ₆ H ₄ OCH ₂
41	2-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
42	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃ OCH ₂
43	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃ OCH ₂
44	3-Cl-C ₆ H ₄ OCH ₂
45	噻吩-2-基-OCH ₂
46	噻吩-3-基-OCH ₂
47	C ₆ H ₅ CH ₂ OCH ₂
48	噻吩-2-基-CH ₂ OCH ₂
49	噻吩-3-基-CH ₂ OCH ₂
50	第三-C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOCH ₂
51	第三-C ₄ H ₉ (CH ₃) ₂ SiOC ₂ H ₄
52	C ₆ H ₅
53	4-第三-C ₄ H ₉ -C ₆ H ₄
54	4-F-C ₆ H ₄
55	4-Cl-C ₆ H ₄
56	4-CH ₃ -C ₆ H ₄
57	4-Br-C ₆ H ₄
58	3CH ₃ CO-C ₆ H ₄
59	3,4-Cl ₂ -C ₆ H ₃
60	3-CF ₃ -C ₆ H ₄
61	3,5-Cl ₂ -C ₆ H ₃
62	4-CF ₃ O-C ₆ H ₄
63	2-CF ₃ -C ₆ H ₄
64	4-CF ₃ -C ₆ H ₄
65	2-Br-C ₆ H ₄
66	2-Cl-C ₆ H ₄
67	2-CH ₃ -4-Cl-C ₆ H ₃
68	2-CH ₃ -5-F-C ₆ H ₃
69	3-Cl-C ₆ H ₄

70	噻吩-2-基
71	噻吩-3-基
72	$\text{C}_6\text{H}_5\text{CH}_2$
73	4-第三- $\text{C}_4\text{H}_9\text{-C}_6\text{H}_4\text{CH}_2$
74	4-F- $\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2$
75	4-Cl- $\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2$
76	4- $\text{CH}_3\text{-C}_6\text{H}_4\text{CH}_2$
77	4-Br- $\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2$
78	2-F- $\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2$
79	3,4- $\text{Cl}_2\text{-C}_6\text{H}_3\text{CH}_2$
80	3- $\text{CF}_3\text{-C}_6\text{H}_4\text{CH}_2$
81	3,5- $\text{Cl}_2\text{-C}_6\text{H}_3\text{CH}_2$
82	4- $\text{CF}_3\text{O-C}_6\text{H}_5\text{CH}_2$
83	2- $\text{CF}_3\text{-C}_6\text{H}_4\text{CH}_2$
84	4- $\text{CF}_3\text{-C}_6\text{H}_4\text{CH}_2$
85	2-Br- $\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2$
86	2-Cl- $\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2$
87	2- $\text{CH}_3\text{-4-Cl-C}_6\text{H}_3\text{CH}_2$
88	2- $\text{CH}_3\text{-5-F-C}_6\text{H}_3\text{CH}_2$
89	3-Cl- $\text{C}_6\text{H}_4\text{CH}_2$
90	$\text{NC}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_2$
91	$\text{Cl}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_2$
92	$\text{F}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_2$
93	NCCH_2CH_2
94	ClCH_2CH_2
95	FCH_2CH_2
96	$\text{CH}_3\text{SO}(\text{CH}_2)_2\text{CH}_2$
97	$\text{CH}_3\text{SO}_2(\text{CH}_2)_2\text{CH}_2$
98	1,2,4-三唑-1-基- $(\text{CH}_2)_2\text{CH}_2$
99	$\text{CH}_3\text{SOCH}_2\text{CH}_2$
100	$\text{CH}_3\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$

101	1,2,4-三唑-1-基-CH ₂ CH ₂
-----	--

表 2

表 2 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 N，Y 為 CH，Z 為 H，R₁ 為甲基，R₂ 為氫，R₃ 與 R₄ 均為甲基，及 R₅ 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 2 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同，惟在表 2 之化合物 1 中，R₁ 為甲基代替乙基。同樣地，表 2 之化合物 2 至 101 均個別與表 1 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 2 之化合物中，R₁ 為甲基代替乙基。

表 3

表 3 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 N，Y 為 CH，Z 為 H，R₁ 為正-丙基，R₂ 為氫，R₃ 與 R₄ 均為甲基，及 R₅ 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 3 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同，惟在表 3 之化合物 1 中，R₁ 為正-丙基代替乙基。同樣地，表 3 之化合物 2 至 101 均個別與表 1 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 3 之化合物中，R₁ 為正-丙基代替乙基。

表 4

表 4 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 N，Y 為 CH，Z 為 H，R₁ 為 2,2,2-三氟乙基，R₂ 為氫，R₃ 與 R₄ 均為甲基，及 R₅ 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 4 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同，惟在表 4 之化合物 1 中，R₁ 為 2,2,2-三氟乙基代替乙基。同樣地，表 4 之化合物 2 至 101 均個別與表 1 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 4 之化合物中，R₁ 為 2,2,2-三氟乙基代替乙基。

表 5

表 5 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 N，Y 為 CH，Z 為 H， R_1 為 氰基 甲基， R_2 為 氫， R_3 與 R_4 均為 甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 5 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同，惟在表 5 之化合物 1 中， R_1 為 氰基 甲基代替 乙基。同樣地，表 5 之化合物 2 至 101 均個別與表 1 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 5 之化合物中， R_1 為 氰基 甲基代替 乙基。

表 6

表 6 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 N，Y 為 CH，Z 為 H， R_1 為 乙 醯基 甲基， R_2 為 氫， R_3 與 R_4 均為 甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 6 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同，惟在表 6 之化合物 1 中， R_1 為 乙 醯基 甲基代替 乙基。同樣地，表 6 之化合物 2 至 101 均個別與表 1 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 6 之化合物中， R_1 為 乙 醯基 甲基代替 乙基。

表 7

表 7 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 N，Y 為 CH，Z 為 H， R_1 為 甲 氧 羰基 甲基， R_2 為 氫， R_3 與 R_4 均為 甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 7 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同，惟在表 7 之化合物 1 中， R_1 為 甲 氧 羰基 甲基代替 乙基。同樣地，表 7 之化合物 2 至 101 均個別與表 1 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 7 之化合物中， R_1 為 甲 氧 羰基 - 甲基代替 乙基。

表 8

表 8 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 N，Y 為 CH，Z 為 H， R_1 為 甲 氧 羰基 乙基， R_2 為 氫， R_3 與 R_4 均為 甲基，及 R_5 具

有表1中所列示之意義。因此，表8之化合物1係與表1之化合物1相同，惟在表8之化合物1中， R_1 為甲氧羰基乙基代替乙基。同樣地，表8之化合物2至101均個別與表1之化合物2至101相同，惟在表8之化合物中， R_1 為甲氧羰基乙基代替乙基。

表9

表9包含101種通式(1)化合物，其中X為N，Y為CH，Z為H， R_1 為羥甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表1中所列示之意義。因此，表9之化合物1係與表1之化合物1相同，惟在表9之化合物1中， R_1 為羥甲基代替乙基。同樣地，表9之化合物2至101均個別與表1之化合物2至101相同，惟在表9之化合物中， R_1 為羥甲基代替乙基。

表10

表10包含101種通式(1)化合物，其中X為N，Y為CH，Z為H， R_1 為氫乙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表1中所列示之意義。因此，表10之化合物1係與表1之化合物1相同，惟在表10之化合物1中， R_1 為羥乙基代替乙基。同樣地，表10之化合物2至101均個別與表1之化合物2至101相同，惟在表10之化合物中， R_1 為羥乙基代替乙基。

表11

表11包含101種通式(1)化合物，其中X為N，Y為CH，Z為H， R_1 為甲氧基甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表1中所列示之意義。因此，表11之化合物1係與表1之化合物1相同，惟在表11之化合物1中， R_1 為甲氧基甲基代替乙

基。同樣地，表 11 之化合物 2 至 101 均個別與表 1 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 11 之化合物中， R_1 為甲氧基甲基代替乙基。

表 12

表 12 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 N，Y 為 CH，Z 為 H， R_1 為甲硫基甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 12 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同，惟在表 12 之化合物 1 中， R_1 為甲硫基甲基代替乙基。同樣地，表 12 之化合物 2 至 101 均個別與表 1 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 12 之化合物中， R_1 為甲硫基甲基代替乙基。

表 13

表 13 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 N，Y 為 CH，Z 為 H， R_1 為乙氧基甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 13 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同，惟在表 13 之化合物 1 中， R_1 為乙氧基甲基代替乙基。同樣地，表 13 之化合物 2 至 101 均個別與表 1 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 13 之化合物中， R_1 為乙氧基甲基代替乙基。

表 14

表 14 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 N，Y 為 CH，Z 為 H， R_1 為 2-甲氧基乙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 14 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同，惟在表 14 之化合物 1 中， R_1 為 2-甲氧基乙基代

替乙基。同樣地，表14之化合物2至101均個別與表1之化合物2至101相同，惟在表14之化合物中， R_1 為2-甲氧基乙基代替乙基。

表 15

表15包含101種通式(1)化合物，其中X為N，Y為CH，Z為H， R_1 為2-甲硫基乙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表1中所列示之意義。因此，表15之化合物1係與表1之化合物1相同，惟在表15之化合物1中， R_1 為2-甲硫基乙基代替乙基。同樣地，表15之化合物2至101均個別與表1之化合物2至101相同，惟在表15之化合物中， R_1 為2-甲硫基乙基代替乙基。

表 16

表16包含101種通式(1)化合物，其中X為N，Y為CH，Z為H， R_1 為甲氧基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表1中所列示之意義。因此，表16之化合物1係與表1之化合物1相同，惟在表16之化合物1中， R_1 為甲氧基代替乙基。同樣地，表16之化合物2至101均個別與表1之化合物2至101相同，惟在表16之化合物中， R_1 為甲氧基代替乙基。

表 17

表17包含101種通式(1)化合物，其中X為N，Y為CH，Z為H， R_1 為乙氧基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表1中所列示之意義。因此，表17之化合物1係與表1之化合物1相同，惟在表17之化合物1中， R_1 為乙氧基代替乙基。同樣地，表17之化合物2至101均個別與表1之化合物2至101相同

，惟在表 17 之化合物中， R_1 為乙氧基代替乙基。

表 18

表 18 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 N，Y 為 CH，Z 為 H， R_1 為正 - 丙氧基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 18 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同，惟在表 18 之化合物 1 中， R_1 為正 - 丙氧基代替乙基。同樣地，表 18 之化合物 2 至 101 均個別與表 1 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 18 之化合物中， R_1 為正 - 丙氧基代替乙基。

表 19

表 19 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 N，Y 為 CH，Z 為 H， R_1 為正 - 丁氧基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 19 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同，惟在表 19 之化合物 1 中， R_1 為正 - 丁氧基代替乙基。同樣地，表 19 之化合物 2 至 101 均個別與表 1 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 19 之化合物中， R_1 為正 - 丁氧基代替乙基。

表 20

表 20 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為乙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 20 之化合物 1 係與表 1 之化合物 1 相同，惟在表 20 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 20 之化合物 2 至 101 均個別與表 1 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 20 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 21

表 21 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H

， R_1 為甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 21 之化合物 1 係與表 2 之化合物 1 相同，惟在表 21 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 21 之化合物 2 至 101 均個別與表 2 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 21 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 22

表 22 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為正-丙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 22 之化合物 1 係與表 3 之化合物 1 相同，惟在表 22 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 22 之化合物 2 至 101 均個別與表 3 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 22 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 23

表 23 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為 2,2,2-三氟乙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 23 之化合物 1 係與表 4 之化合物 1 相同，惟在表 23 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 23 之化合物 2 至 101 均個別與表 4 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 23 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 24

表 24 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為氰基甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 24 之化合物 1 係與表 5 之化合物 1 相同，惟在表 24 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 24

之化合物 2 至 101 均個別與表 5 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 24 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 25

表 25 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為乙醯基甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 25 之化合物 1 係與表 6 之化合物 1 相同，惟在表 25 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 25 之化合物 2 至 101 均個別與表 6 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 25 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 26

表 26 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為甲氧羰基甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 26 之化合物 1 係與表 7 之化合物 1 相同，惟在表 26 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 26 之化合物 2 至 101 均個別與表 7 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 26 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 27

表 27 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為甲氧羰基乙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 27 之化合物 1 係與表 8 之化合物 1 相同，惟在表 27 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 27 之化合物 2 至 101 均個別與表 8 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 27 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 28

表 28 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為羥甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 28 之化合物 1 係與表 9 之化合物 1 相同，惟在表 28 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 28 之化合物 2 至 101 均個別與表 9 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 28 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 29

表 29 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為氫乙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 29 之化合物 1 係與表 10 之化合物 1 相同，惟在表 29 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 29 之化合物 2 至 101 均個別與表 10 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 29 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 30

表 30 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為甲氧基甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 30 之化合物 1 係與表 11 之化合物 1 相同，惟在表 30 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 30 之化合物 2 至 101 均個別與表 11 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 30 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 31

表 31 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為甲硫基甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 31 之化合物 1 係與表 12 之化合

物 1 相同，惟在表 31 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 31 之化合物 2 至 101 均個別與表 12 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 31 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 32

表 32 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為乙氧基甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 32 之化合物 1 係與表 13 之化合物 1 相同，惟在表 32 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 32 之化合物 2 至 101 均個別與表 13 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 32 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 33

表 33 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為 2-甲氧基乙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 33 之化合物 1 係與表 14 之化合物 1 相同，惟在表 33 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 33 之化合物 2 至 101 均個別與表 14 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 33 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 34

表 34 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為 2-甲硫基乙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 34 之化合物 1 係與表 15 之化合物 1 相同，惟在表 34 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 34 之化合物 2 至 101 均個別與表 15 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 34 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 35

表 35 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為甲氧基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 35 之化合物 1 係與表 16 之化合物 1 相同，惟在表 35 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 35 之化合物 2 至 101 均個別與表 16 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 35 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 36

表 36 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為乙氧基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 36 之化合物 1 係與表 17 之化合物 1 相同，惟在表 36 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 36 之化合物 2 至 101 均個別與表 17 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 36 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 37

表 37 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為正-丙氧基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 37 之化合物 1 係與表 18 之化合物 1 相同，惟在表 37 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH。同樣地，表 37 之化合物 2 至 101 均個別與表 18 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 37 之化合物中，Y 為 N 代替 CH。

表 38

表 38 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 與 Y 均為 N，Z 為 H， R_1 為正-丁氧基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1

中所列示之意義。因此，表38之化合物1係與表19之化合物1相同，惟在表38之化合物1中，Y為N代替CH。同樣地，表38之化合物2至101均個別與表19之化合物2至101相同，惟在表38之化合物中，Y為N代替CH。

表 39

表39包含101種通式(1)化合物，其中X為CH，Y為N，Z為H， R_1 為乙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表1中所列示之意義。因此，表39之化合物1係與表1之化合物1相同，惟在表39之化合物1中，Y為N代替CH，且X為CH代替N。同樣地，表39之化合物2至101均個別與表1之化合物2至101相同，惟在表39之化合物中，Y為N代替CH，且X為CH代替N。

表 40

表40包含101種通式(1)化合物，其中X為CH，Y為N，Z為H， R_1 為甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表1中所列示之意義。因此，表40之化合物1係與表2之化合物1相同，惟在表40之化合物1中，Y為N代替CH，且X為CH代替N。同樣地，表40之化合物2至101均個別與表2之化合物2至101相同，惟在表40之化合物中，Y為N代替CH，且X為CH代替N。

表 41

表41包含101種通式(1)化合物，其中X為CH，Y為N，Z為H， R_1 為正-丙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表1中所列示之意義。因此，表41之化合物1係與表3之化合物1

相同，惟在表 41 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 41 之化合物 2 至 101 均個別與表 3 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 41 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 42

表 42 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為 2,2,2-三氟乙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 42 之化合物 1 係與表 4 之化合物 1 相同，惟在表 42 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 42 之化合物 2 至 101 均個別與表 4 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 42 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 43

表 43 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為氰基甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 43 之化合物 1 係與表 5 之化合物 1 相同，惟在表 43 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 43 之化合物 2 至 101 均個別與表 5 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 43 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 44

表 44 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為乙醯基甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 44 之化合物 1 係與表 6 之化

物 1 相同，惟在表 44 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 44 之化合物 2 至 101 均個別與表 6 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 44 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 45

表 45 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為甲氧羰基甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 45 之化合物 1 係與表 7 之化合物 1 相同，惟在表 45 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 45 之化合物 2 至 101 均個別與表 7 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 45 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 46

表 46 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為甲氧羰基乙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 46 之化合物 1 係與表 8 之化合物 1 相同，惟在表 46 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 46 之化合物 2 至 101 均個別與表 8 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 46 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 47

表 47 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為羥甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 47 之化合物 1 係與表 9 之化合物 1

相同，惟在表 47 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 47 之化合物 2 至 101 均個別與表 9 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 47 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 48

表 48 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為氫乙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 48 之化合物 1 係與表 10 之化合物 1 相同，惟在表 48 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 48 之化合物 2 至 101 均個別與表 10 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 48 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 49

表 49 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為甲氧基甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 49 之化合物 1 係與表 11 之化合物 1 相同，惟在表 49 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 49 之化合物 2 至 101 均個別與表 11 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 49 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 50

表 50 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為甲硫基甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 50 之化合物 1 係與表 12 之化

合物 1 相同，惟在表 50 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 50 之化合物 2 至 101 均個別與表 12 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 50 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 51

表 51 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為乙氧基甲基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 51 之化合物 1 係與表 13 之化合物 1 相同，惟在表 51 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 51 之化合物 2 至 101 均個別與表 13 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 51 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 52

表 52 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為 2-甲氧基乙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 52 之化合物 1 係與表 14 之化合物 1 相同，惟在表 52 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 52 之化合物 2 至 101 均個別與表 14 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 52 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 53

表 53 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為 2-甲硫基乙基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 53 之化合物 1 係與表 15 之

化合物 1 相同，惟在表 53 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 53 之化合物 2 至 101 均個別與表 15 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 53 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 54

表 54 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為甲氧基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 54 之化合物 1 係與表 16 之化合物 1 相同，惟在表 54 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 54 之化合物 2 至 101 均個別與表 1 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 16 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 55

表 55 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為乙氧基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 55 之化合物 1 係與表 17 之化合物 1 相同，惟在表 55 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 55 之化合物 2 至 101 均個別與表 17 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 55 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 56

表 56 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為正 - 丙氧基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 56 之化合物 1 係與表 18 之化

合物 1 相同，惟在表 56 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 56 之化合物 2 至 101 均個別與表 18 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 56 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 57

表 57 包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 CH，Y 為 N，Z 為 H， R_1 為正-丁氧基， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。因此，表 57 之化合物 1 係與表 19 之化合物 1 相同，惟在表 57 之化合物 1 中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。同樣地，表 57 之化合物 2 至 101 均個別與表 19 之化合物 2 至 101 相同，惟在表 57 之化合物中，Y 為 N 代替 CH，且 X 為 CH 代替 N。

表 58 至 76

表 58 至 76 各包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 N，Y 為 CCl，Z 為 H， R_1 係如表 1 至 19 中之定義， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。此等表係與表 1 至 19 相同（意即表 58 係與表 1 相同，表 59 係與表 2 相同，等等），惟於各表 58 至 76 中，Y 為 CCl 代替 CH。在表 58 至 76 中之 R_1 係個別具有相應於其在表 1 至 19 中之意義（意即表 58 具有如表 1 之 R_1 之相同意義，表 59 具有如表 2 之 R_1 之相同意義，等等）。

表 77 至 95

表 77 至 95 各包含 101 種通式 (1) 化合物，其中 X 為 N，Y 為 CBr，Z 為 H， R_1 係如表 1 至 19 中之定義， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。此等表係與表 1 至 19 相

同(意即表 77 係與表 1 相同，表 78 係與表 2 相同，等等)，惟於各表 77 至 95 中，Y 為 CBr 代替 CH。在表 77 至 95 中之 R_1 係個別具有相應於其在表 1 至 19 中之意義(意即表 77 具有如表 1 之 R_1 之相同意義，表 78 具有如表 2 之 R_1 之相同意義，等等)。

表 96 至 114

表 96 至 114 各包含 101 種通式(1)化合物，其中 X 為 N，Y 為 CCN，Z 為 H， R_1 係如表 1 至 19 中之定義， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。此等表係與表 1 至 19 相同(意即表 96 係與表 1 相同，表 97 係與表 2 相同，等等)，惟於各表 96 至 114 中，Y 為 CCN 代替 CH。在表 96 至 114 中之 R_1 係個別具有相應於其在表 1 至 19 中之意義(意即表 96 具有如表 1 之 R_1 之相同意義，表 97 具有如表 2 之 R_1 之相同意義，等等)。

表 115 至 133

表 115 至 133 各包含 101 種通式(1)化合物，其中 X 為 N，Y 為 CBr，Z 為 Br， R_1 係如表 1 至 19 中之定義， R_2 為氫， R_3 與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。此等表係與表 1 至 19 相同(意即表 115 係與表 1 相同，表 116 係與表 2 相同，等等)，惟於各表 115 至 133 中，Y 為 CBr 代替 CH，且 Z 為 Br 代替 H。在表 115 至 133 中之 R_1 係個別具有相應於其在表 1 至 19 中之意義(意即表 115 具有如表 1 之 R_1 之相同意義，表 116 具有如表 2 之 R_1 之相同意義，等等)。

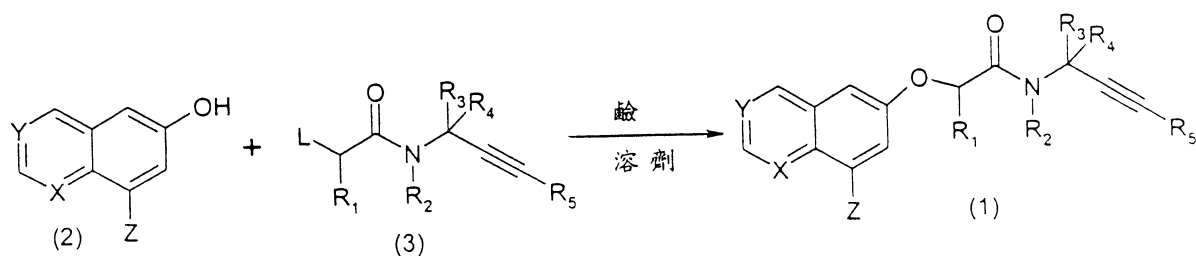
表 134 至 152

表 134 至 152 各包含 101 種通式(1)化合物，其中 X 為 N-氧化物，Y 為 CH，Z 為 H， R_1 係如表 1 至 19 中之定義， R_2 為氫， R_3

與 R_4 均為甲基，及 R_5 具有表 1 中所列示之意義。此等表係與表 1 至 19 相同（意即表 134 係與表 1 相同，表 135 係與表 2 相同，等等），惟於各表 134 至 152 中，X 為 N-氧化物代替 N。在表 134 至 152 中之 R_1 係個別具有相應於其在表 1 至 19 中之意義（意即表 134 具有如表 1 之 R_1 之相同意義，表 135 具有如表 2 之 R_1 之相同意義，等等）。

式 (1) 化合物可按下文圖式 1 至 10 中所概述者製備，其中 X, Y, Z, R_1 , R_2 , R_3 , R_4 及 R_5 均具有上文所予之意義，R 為 C_{1-4} 烷基， R_6 為直鏈 C_{1-4} 烷基， R_7 與 R_8 係獨立為 H 或 C_{1-4} 烷基，L 為脫離基，譬如鹵化物，例如碘化物，烷基或芳基磺醯基氧基，例如甲基磺醯基氧基與甲苯磺醯基氧基，或三氟甲烷磺酸酯，Hal 為鹵素， R_a 為氫或 C_{1-3} 烷基， R_b 為氫或 C_{1-3} 烷基，其條件是 R_a 與 R_b 中之碳原子總數不超過三， R_c 為 C_{1-6} 烷基、視情況經取代之苄基或視情況經取代之噻吩基甲基，及 R_d 具有本文中歸屬於其之意義。

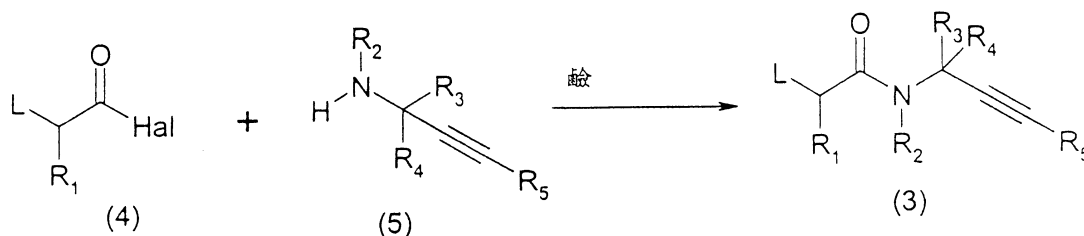
如圖式 1 中所示，通式 (1) 化合物可經由使通式 (2) 化合物與通式 (3) 化合物，於鹼存在下，在適當溶劑中反應而製成。典型溶劑包括 N,N-二甲基-甲醯胺與 N-甲基四氫吡咯-2-酮。適當鹼包括碳酸鉀、氫化鈉或二異丙基乙胺。



圖式 1

如圖式 2 中所示，通式 (3) 化合物可經由使通式 (5) 胺與通式 (4) 鹵化醯或其相應之酸酐，於適當無機或有機鹼譬如碳酸鉀或二異丙基乙胺存在下，在溶劑譬如二氯甲烷或四氫呋喃中反應而製成。

圖式 2

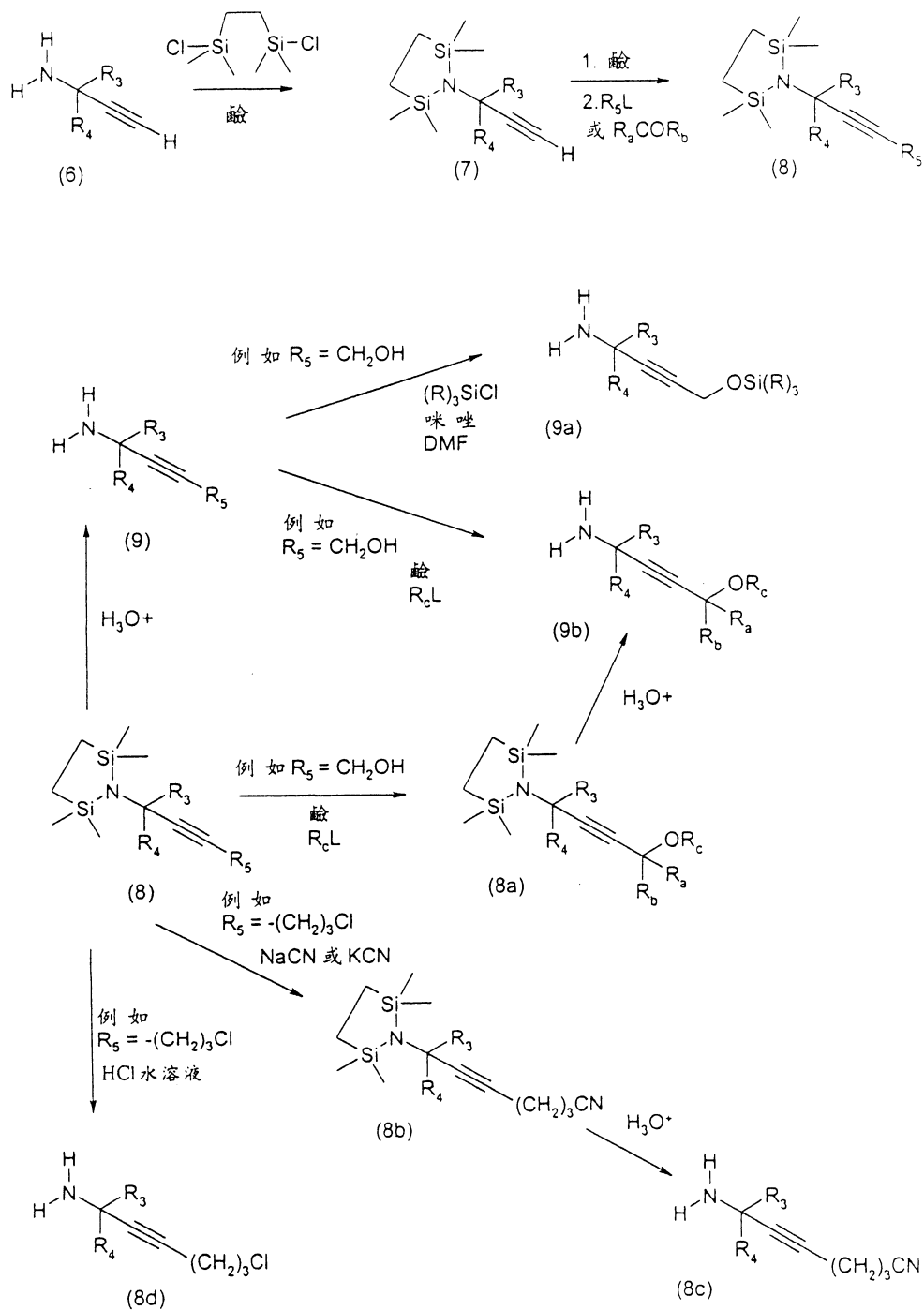


如圖式 3 中所示，通式 (5) 胺類，其中 R_2 為 H，係相應於通式 (9) 胺類，並可藉由通式 (7) 經矽烷基保護之胺基炔，使用適當鹼譬如正-丁基鋰之烷基化作用，接著是與適當烷基化試劑 R_5L 之反應而製成，譬如烷基碘化物，例如碘化甲烷，以形成通式 (8) 經烷基化之化合物。以類似程序，可使通式 (7) 經矽烷基保護之胺基炔與羰基衍生物 R_aCOR_b ，例如甲醛，使用適當鹼，譬如正-丁基鋰，進行反應，以提供含有羥烷基部份基團之胺基炔 (8)。然後，可以例如含水酸，自通式 (8) 化合物移除矽烷基保護基，以形成通式 (9) 胺基炔。可使通式 (9) 胺基炔類進一步衍化，例如當 R_5 為羥烷基時，例如經由使通式 (9) 化合物與矽烷基化劑 $(\text{R})_3\text{SiCl}$ 反應，例如氯化第三-丁基二甲基矽烷，獲得於通式 (9a) 之氧上經矽烷基化之衍生物。此外，可將通式 (9) 化合物以鹼譬如氫化鈉或鉀雙 (

三甲基矽烷基)胺，接著以化合物 R_cL 處理，獲得通式 (9b) 化合物。在一種替代順序中，可將通式 (8) 化合物以鹼譬如鈉或鉀雙(三甲基矽烷基)胺，接著以化合物 R_cL 處理，其中 L 表示鹵素或磺酸酯，譬如 OSO_2Me 或 $OSO_2-4-甲苯基$ ，例如碘化乙烷，獲得通式 (8a) 化合物，其在移除矽烷基保護基後，係獲得通式 (9b) 化合物。

可使通式 (8) 化合物，其中 R_5 為例如 3-氯基丙基，與金屬氰化物鹽反應，譬如氰化鈉，獲得通式 (8b) 化合物，然後，可以例如含水酸使其水解，獲得通式 (8c) 胺類。可使通式 (8) 化合物，其中 R_5 為例如 3-氯基丙基，以例如含水酸水解，獲得通式 (8d) 胺類。

圖式 3



通式 (7) 經矽烷基保護之胺基炔類可經由使通式 (6) 胺類與 1,2-雙-(氯基二甲基矽烷基)乙烷，於適當鹼譬如三級有機胺鹼例如三乙胺存在下反應而獲得。

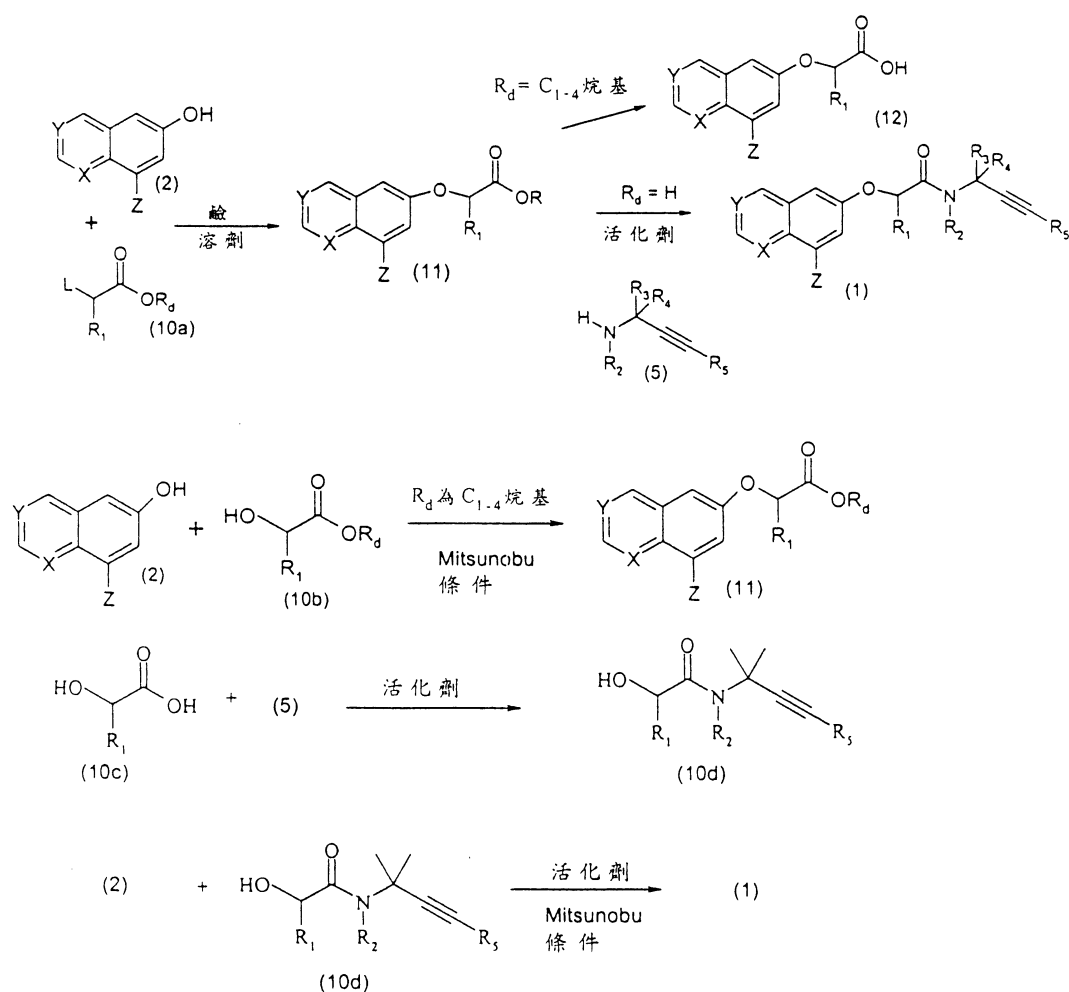
通式 (6) 胺類為無論是市購可得，或可藉由標準文獻方法

製成(參閱, 例如 EP-A-0834498)。

或者, 如圖式4中所示, 通式(1)化合物可經由通式(11)化合物, 其中R為H, 與通式(5)胺, 使用適當活化試劑, 譬如1-羥基-苯并三唑與N-(3-二甲氨基丙基)-N'-乙基-碳化二亞胺鹽酸鹽, 進行縮合而製成。

在R₂不為氫之情況下, 可藉已知技術將R₂引進通式(9)胺基炔中, 以形成通式(5)胺。

圖式4



通式(12)化合物可藉由通式(11)相應酯類, 其中R_d為C₁₋₄烷

基，使用已知技術之水解作用製成。通式(11)酯類，其中 R_d 為 C_{1-4} 烷基，以及通式(11)酸，其中 R_d 為H，可經由使通式(2)化合物與通式(10a)酯或酸，於適當鹼譬如碳酸鉀或氫化鈉存在下，在適當溶劑譬如N,N-二甲基甲醯胺中反應而製成。通式(10a)酯類或酸係為無論是市購可得，或可藉由標準文獻方法製自市購可得之物質。

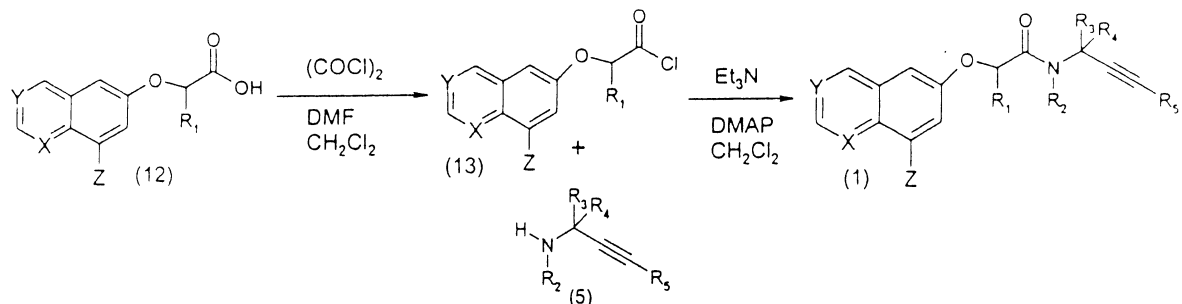
或者，如圖式4中所示，通式(11)化合物可於Mitsunobu條件下，經由使通式(2)化合物與通式(10b)化合物，其中 R_d 為 C_{1-4} 烷基，使用膦譬如三苯膦，與偶氮基酯譬如偶氮二羧酸二乙酯，反應而製成。

同樣地，通式(1)化合物可經由使通式(10d)化合物與通式(2)化合物，於Mitsunobu條件下，使用膦譬如三苯膦，與偶氮基酯譬如偶氮二羧酸二乙酯，反應而製成。通式(10d)化合物可製自通式(10c)化合物與通式(5)胺，使用適當活化試劑，譬如1-羥基苯并三唑與N-(3-二甲胺基-丙基)-N'-乙基-碳化二亞胺鹽酸鹽。化合物(10b)與(10c)係為無論是已知化合物或可製自已知化合物。

在另一種方法中，通式(1)化合物可經由使通式(13)鹵化醯與通式(5)胺，在適當溶劑譬如二氯甲烷中，於三級胺譬如三乙胺與活化劑譬如4-二甲胺基吡啶存在下反應而製成。

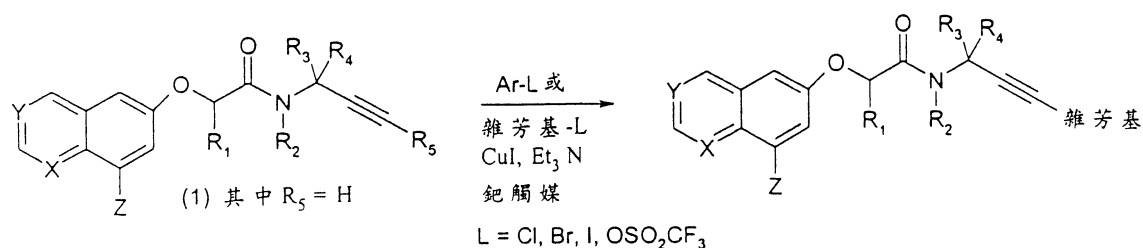
如圖式5中所示，通式(13)鹵化醯可經由使通式(12)化合物以適當氯化劑譬如氯化草醯，在適當溶劑譬如二氯甲烷中，且於例如N,N-二甲基甲醯胺存在下氯化而製成。通式(12)化合物係相應於通式(11)化合物，其中R為H。

圖式 5



如圖式 6 中所示，通式 (1) 化合物，其中 R_5 為 H，可於 Sonogashira 條件下，與例如視情況經取代之苯基或噻吩基氯化物、溴化物、碘化物或三氟甲烷磺酸酯反應，以形成通式 (1) 經取代之苯基或噻吩基化合物，其中 R_5 為視情況經取代之苯基或噻吩基。適當鈀觸媒為肆(三苯膦)-鈀 (0)。

圖式 6

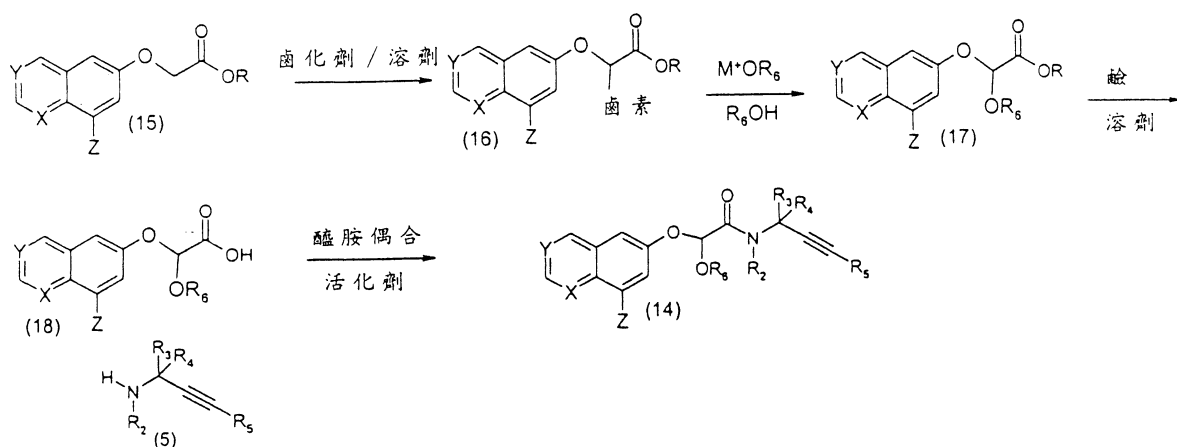


通式 (1) 化合物，其中 R_1 為直鏈 C_{1-4} 烷氧基，譬如通式 (14) 化合物，其中 R_6 係如上文定義，可按圖式 7 中所示製成。因此，可使式 (15) 酯類鹵化，而得通式 (16) 鹵基酯，其方式是以適當鹵化劑，譬如 N-溴基琥珀醯亞胺，在適當溶劑中，譬如四氯化碳，在環境溫度與溶劑回流溫度之間處理。可使通式 (16) 鹵基酯與鹼金屬化合物 M^+OR_6 ，其中 M 適當地為鈉或鉀，在例如醇 R_6OH 作為溶劑中，於 0°C 與 40°C 之間，較佳係在環境溫度下反應，獲得通式 (17) 化合物。可使酯類 (17) 水解成通式 (18) 酸，其方式是以鹼金屬氫氧化物，譬如氫氧

化鈉，在含水醇 R_6OH 中，於環境溫度與回流之間處理。

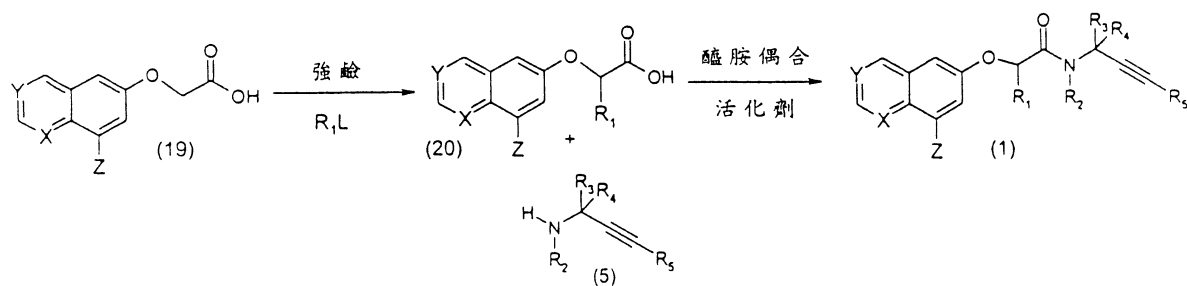
可使通式(18)羧酸與通式(5)胺縮合，而得通式(14)化合物，其中 R_6 係如上文定義，使用適當活化試劑，譬如1-羥基苯并三唑與N-(3-二甲胺基丙基)-N'-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽。

圖式7



通式(1)化合物，其中 R_1 為 C_{1-4} 烷基、 C_{3-4} 烯基、 C_{3-4} 炔基或烷氧烷基，其中碳原子總數為2或3，可按圖式8中所示製成。因此，可將經取代之醋酸(19)以至少兩當量之鹼處理，譬如鋰二異丙基胺，在適當溶劑譬如四氫呋喃中，於 $-78^\circ C$ 與環境溫度間之溫度下，使用烷基化劑譬如 R_1L ，於酸化作用時，獲得通式(20)羧酸類。

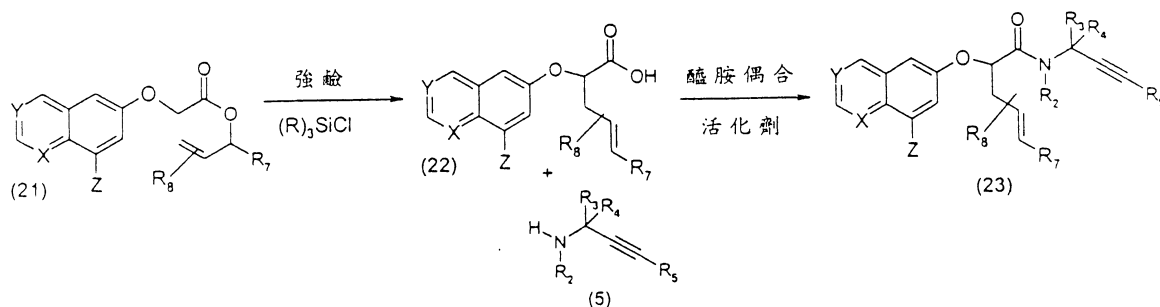
圖式8



如圖式9中所示，通式(1)化合物，其中 R_1 為 C_{3-6} 烯基，可製自通式(21)酯類，其中 R_7 與 R_8 均如上文定義。將通式(21)

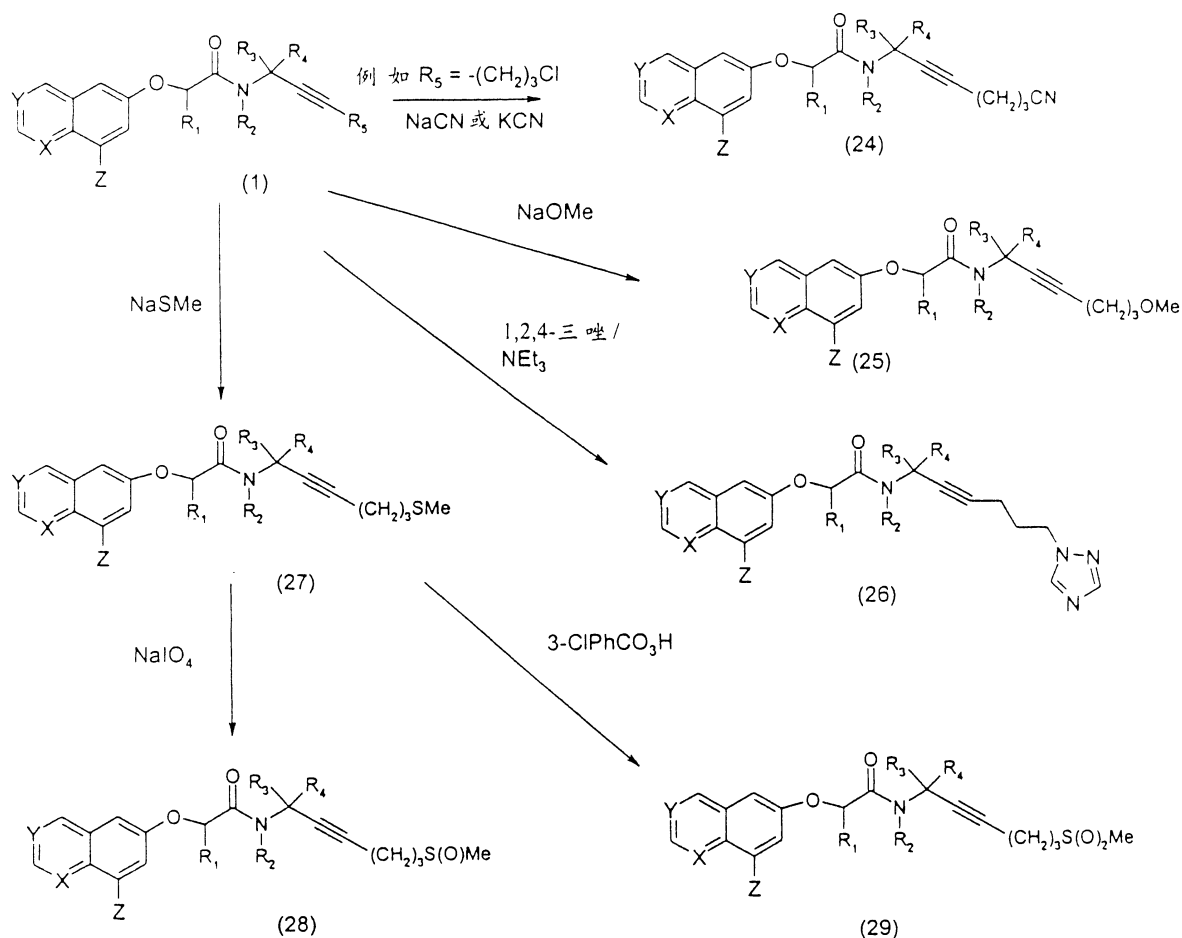
酯類以強鹼譬如鋰雙(三甲基矽烷基)胺，在 -78°C 與環境溫度之間，較佳係在 -78°C 下處理，然後與氯化三烷基矽烷 $(\text{R})_3\text{SiCl}$ 反應，譬如氯化三甲基矽烷或三氟甲烷磺酸三烷基矽烷基酯 $(\text{R})_3\text{SiOSO}_2\text{CF}_3$ ，並使其溫熱至環境溫度。可使水解作用後獲得之所形成通式(22)酸與通式(5)胺類縮合，而得通式(23)化合物，使用適當活化試劑，譬如1-羥基-苯并三唑與N-(3-二甲胺基丙基)-N'-乙基-碳化二亞胺鹽酸鹽。

圖式 9



如圖式 10 中所示，可使通式(1)化合物，其中 R_5 為例如 3-氯基丙基，與各種親核劑，譬如金屬氰化物鹽，例如氰化鈉，反應而獲得通式(24)化合物，與金屬烷氧化物，例如甲醇鈉，反應而獲得通式(25)化合物，與 1,2,4-三唑，於鹼譬如三乙胺存在下，反應而獲得通式(26)化合物，及與金屬硫代烷氧化物，例如甲烷硫醇化鈉，反應而獲得通式(27)化合物。可將通式(27)化合物以氧化劑譬如過碘酸鈉處理，而得通式(28)亞砷，或以氧化劑譬如 3-氯過苯甲酸處理，而得通式(29)砷類。

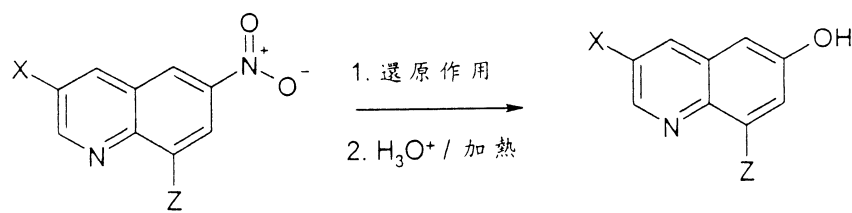
圖式 10



製備適合用於轉變成視情況經取代之羥基-喹啉類之視情況經取代之羥基喹啉或經取代之喹啉類之方法，可參閱文獻，例如雜環族化合物化學，G. Jones 編著，John Wiley, Interscience, London 及其中引述之參考資料。

例如，如圖式 11 中所示，可使視情況在 3 或 8 或 3 與 8 位置上經取代之 6-硝基喹啉，還原成其相應之視情況經取代之 6-胺基喹啉類。然後，可使此等胺基喹啉類，使用例如強含水酸，譬如硫酸、磷酸或鹽酸，水解成相應之視情況經取代之 6-羥基喹啉。

圖式 11



例如 X = H、鹵基
Z = H、鹵基、烷基、烷氧基等

製備適合用於轉變成經取代之羥基喹啉之視情況經取代之羥基喹啉或經取代之喹啉之方法，可參閱文獻，例如雜環族化合物化學，D. J. Brown 編著，John Wiley, Interscience, London 及其中引述之參考資料。

本發明之其他化合物可使用已知程序，經由使通式(1)化合物中之取代基轉變而製成，例如藉由通式(1)其中 R₂ 為 H 或 R₅ 為 H 之化合物之烷基化作用。

式(1)化合物為活性殺真菌劑，且可用以防治一或多種下列病原：於稻米與小麥上之稻梨孢 (*Magnaporthe grisea*) 及於其他宿主上之其他梨孢霉屬；於小麥上之小麥柄銹菌(或小麥葉銹菌)、條形柄銹菌及其他銹菌，於大麥上之大麥柄銹菌、條形柄銹菌及其他銹菌，及於其他宿主(例如草地、裸麥、咖啡、梨子、蘋果、花生、糖甜菜、植物及裝飾植物)上之銹菌；於葫蘆(例如甜瓜)上之二孢白粉菌；於大麥、小麥、裸麥及草地上之禾粉霉(或白粉菌屬)(麥類白粉病)，及於各種宿主上之其他粉狀霉菌，譬如於蛇麻草上之斑點單絲殼，於葫蘆(例如胡瓜)上之褐單絲殼(蒼耳單絲殼)，於番茄、茄子及綠胡椒上之韃靼內絲白粉菌，於蘋果上之白叉

絲單囊殼，及於藤本植物上之葡萄鉤絲殼；於穀類(例如小麥、大麥、裸麥)、草地及其他宿主上之旋孢腔菌屬、長蠕孢屬、Drechslera屬(核腔菌屬)、喙孢屬、禾生球腔菌(小麥殼針孢)及穎枯暗球殼(穎枯殼多孢或穎枯殼針孢)、卷毛狀假小尾孢及禾頂囊殼；於花生上之落花生尾孢與球座尾孢，及於其他宿主例如糖甜菜、香蕉、大豆及稻米上之其他尾孢屬；於番茄、草莓、蔬菜、藤本植物及其他宿主上之灰葡萄孢(灰霉)，及於其他宿主上之其他葡萄孢屬；於蔬菜(例如胡蘿蔔)、油菜籽、蘋果、番茄、馬鈴薯、穀類(例如小麥)及其他宿主上之鏈格孢屬；於蘋果、梨子、核果、樹堅果及其他宿主上之黑星菌屬(包括蘋果黑星菌(黑點病))；於一範圍宿主包括穀類(例如小麥)與番茄上之枝孢屬；於核果、樹堅果及其他宿主上之鏈核盤菌屬；於番茄、草地、小麥、葫蘆及其他宿主上之亞隔孢殼屬；於油菜籽、草地、稻米、馬鈴薯、小麥及其他宿主上之莖點霉屬；於小麥、木材及其他宿主上之曲霉屬與短梗霉屬；於豌豆、小麥、大麥及其他宿主上之殼二孢屬；於蘋果、梨子、洋蔥及其他宿主上之匍柄霉屬(格孢腔菌屬)；於蘋果與梨子上之夏季疾病(例如苦腐病(圍小叢殼)、黑腐病或葉部斑點病(鈍圓葡萄座腔菌)、Brooks果實斑點(仁果球腔菌)、紅檜蘋果銹病(弗吉尼亞檜膠銹菌)、煤霉病(仁果黏殼孢)、蠅糞病(仁果裂盾菌)及白腐病(葡萄座腔菌))；於藤本植物上之葡萄生單軸霉；其他絨毛霉菌，譬如於萵苣上之萵苣盤梗霉，於大豆、煙草、洋蔥及其他宿主上之霜霉屬，於蛇麻草上

之葎草假霜霉，及於葫蘆上之古巴假霜霉；於草地及其他宿主上之腐霉屬(包括終極腐霉)；於馬鈴薯與番茄上之致病疫霉，及於蔬菜、草莓、酪梨、胡椒、裝飾植物、煙草、可可及其他宿主上之其他疫霉屬；於稻米與草地上之瓜亡革菌，及於各種宿主，譬如小麥與大麥、花生、蔬菜、棉花及草地上之其他絲核菌屬；於草地、花生、馬鈴薯、油菜籽及其他宿主上之核盤菌屬；於草地、花生及其他宿主上之小核菌屬；於稻米上藤倉赤霉；於一範圍宿主包括草地、咖啡及蔬菜上之刺盤孢屬；於草地上之 *Laetisaria fuciformis*；於香蕉、花生、柑橘、山核桃、木瓜及其他宿主上之球腔菌屬；於柑橘、大豆、瓜、梨子、羽扇豆及其他宿主上之間座殼屬；於柑橘、藤本植物、橄欖、山核桃、薔薇及其他宿主上之痂囊腔菌屬；於一範圍宿主包括蛇麻草、馬鈴薯及番茄上之輪枝孢屬；於油菜籽及其他宿主上之埋核盤菌屬；於可可樹上之可可豆 *Oncobasidium*，其會造成脈管條紋回枯病；於多種宿主上之鐮孢菌屬、核瑚菌屬、*Microdochium nivale*、黑粉菌屬、條黑粉菌屬、腥黑粉菌屬及麥角菌，但特別是小麥、大麥、草地及玉米；於糖甜菜、大麥及其他宿主上之柱隔孢屬；採收後疾病，特別是果實(例如於橘子上之指狀青霉、意大利青霉及綠色木霉，於香蕉上之芭蕉刺盤孢與香蕉盤長孢，及於葡萄上之灰葡萄孢)；於藤本植物上之其他病原，特別是叢毛彎孢殼、葡萄球座菌、火木層孔菌、葡萄生擬莖點霉、維管束假盤菌及毛鞘革菌；於樹木(例如 *sediciosum* 散斑殼)或木材上之其他病原，特別是芳

香 *Cephalosporium*、長喙殼屬、雲杉 *Ophiostoma*、青霉屬、假康寧木霉、綠色木霉、*harzianum* 木霉、黑曲霉、*Leptographium lindbergi* 及出芽短梗霉；及病毒疾病之真菌載體(例如於穀類上之多黏霉，作為大麥黃色鑲嵌病毒(BYMV)之載體，及於糖甜菜上之甜菜多黏霉，作為根狀病毒之載體)。

式(I)化合物顯示抵抗卵菌綱病原種類之特別良好活性，譬如致病疫霉，單軸霉屬物種，例如葡萄生單軸霉，及腐霉屬物種，例如終極腐霉。

式(1)化合物可在植物組織中趨向頂端地、趨向底部地或局部地移動，以活性地抵抗一或多種真菌。再者，式(1)化合物可為足夠揮發性，以在氣相中具活性，抵抗植物上之一或多種真菌。

因此，本發明係提供一種撲滅或防治植物病原真菌之方法，其包括將殺真菌上有效量之式(1)化合物或含有式(1)化合物之組合物，施用至植物，至植物之種子，至植物或種子之地點，或至土壤或任何其他植物生長培養基，例如營養溶液。

於本文中使用的"植物"一詞，包括籽苗、矮灌木及樹。再者，本發明之殺真菌方法係包括保護、治病、系統、撲滅及抗芽孢處理。

對農業、園藝及草皮目的而言，式(1)化合物較佳係以組合物形式使用。

為將式(1)化合物施加至植物，至植物之種子，至植物或種子之地點，或至土壤或任何其他生長培養基，通常係將

式(1)化合物調配成組合物，其除了式(1)化合物以外，係包含適當惰性稀釋劑或載劑，及選用之表面活性劑(SFA)。SFA為化學品，其能夠經由降低界面張力，改變界面(例如液體/固體，液體/空氣或液體/液體界面)之性質，並藉以導致其他性質(例如分散、乳化及潤濕)之改變。較佳情況是，所有組合物(固體與液體兩種配方)，以重量計，係包含0.0001至95%，更佳為1至85%，例如5至60%之式(1)化合物。此組合物一般係用於防治真菌，以致式(1)化合物係在每公頃0.1克至10公斤，較佳為每公頃1克至6公斤，更佳為每公頃1克至1公斤之比率下施加。

當使用於種子敷料時，式(1)化合物係在每千克種子0.0001克至10克(例如0.001克或0.05克)，較佳為0.005克至10克，更佳為0.005克至4克之比率下使用。

於另一方面，本發明係提供一種殺真菌組合物，其包含殺真菌上有效量之式(1)化合物，及供其使用之適當載劑或稀釋劑。

於又另一方面，本發明係提供一種在一地點撲滅與防治真菌之方法，其包括以包含式(1)化合物之殺真菌上有效量之組合物處理該真菌或該真菌地點。

組合物可選自多種配方類型，包括可撒粉末(DP)、可溶性粉末(SP)、水溶性顆粒(SG)、水可分散性顆粒(WG)、可潤濕粉末(WP)、顆粒(GR)(緩慢或快速釋出)、可溶性濃縮液(SL)、油可溶混液體(OL)、超低體積液體(UL)、可乳化濃縮液(EC)、可分散性濃縮液(DC)、乳化液(油在水中型(EW)與水在油

中型(EO)兩者)、微乳化液(ME)、懸浮濃縮液(SC)、氣溶膠、成霧/煙霧配方、膠囊懸浮液(CS)及種子處理配方。在任何情況中選擇之配方類型，係依所設想之特定目的與式(1)化合物之物理、化學及生物學性質而定。

可撒粉末(DP)可經由使式(1)化合物與一或多種固體稀釋劑(例如天然黏土、高嶺土、葉蠟石、膨土、氧化鋁、蒙脫土、矽藻土、白堊、矽藻土、磷酸鈣、碳酸鈣與鎂、硫磺、石灰、麵粉、滑石及其他有機與無機固體載劑)混合，並以機械方式將混合物研磨至微細粉末而製成。

可溶性粉末(SP)可經由使式(1)化合物與一或多種水溶性無機鹽(譬如碳酸氫鈉、碳酸鈉或硫酸鎂)，或一或多種水溶性有機固體(譬如多醣)，及視情況選用之一或多種潤濕劑，一或多種分散劑，或該作用劑之混合物混合而製成，以改良水分散性/溶解度。然後，將混合物研磨成微細粉末。類似組合物亦可被粒化，以形成水溶性顆粒(SG)。

可潤濕粉末(WP)可經由使式(1)化合物與一或多種固體稀釋劑或載劑，一或多種潤濕劑，且較佳為一或多種分散劑，及視情況選用之一或多種懸浮劑混合而製成，以幫助在液體中分散。然後，將混合物研磨成微細粉末。類似組合物亦可被粒化，以形成水可分散性顆粒(WG)。

顆粒(GR)可無論是經由使式(1)化合物與一或多種粉末狀固體稀釋劑或載劑之混合物粒化而形成，或製自預成形之坯料顆粒，其方式是使式(1)化合物(或其在適當溶劑中之溶液)吸收至多孔性粒狀材料(譬如浮石、鎂鋁海泡石黏土、漂白

土、砂藻土、矽藻土或經磨碎玉米穗軸)中，或經由使式(1)化合物(或其在適當溶劑中之溶液)吸附於堅硬核芯材料(譬如砂、矽酸鹽、礦物碳酸鹽、硫酸鹽或磷酸鹽)，且若必要，則乾燥。常用以輔助吸收或吸附之作用劑，包括溶劑(譬如脂族與芳族石油溶劑、醇類、醚類、酮類及酯類)與黏附劑(譬如聚醋酸乙烯酯、聚乙烯醇、糊精、糖類及植物油)。一或多種其他添加劑亦可被加入顆粒中(例如乳化劑、潤濕劑或分散劑)。

可分散性濃縮液(DC)可經由使式(1)化合物溶於水或有機溶劑譬如酮、醇或二醇醚中而製成。此等溶液可含有表面活性劑(例如用以改良水稀釋作用或防止在噴洒槽桶中之結晶化作用)。

可乳化濃縮液(EC)或油在水中型乳化液(EW)可經由使式(1)化合物溶於有機溶劑(視情況含有一或多種潤濕劑、一或多種乳化劑或該作用劑之混合物)中而製成。供使用於EC中之適當有機溶劑，包括芳族烴類(譬如烷基苯類或烷基萘類，其實例為 SOLVESSO 100、SOLVESSO 150 及 SOLVESSO 200；SOLVESSO 為註冊商標)，酮類(譬如環己酮或甲基環己酮)、醇類(譬如苕醇、呋喃甲醇或丁醇)、N-烷基四氫吡咯酮類(譬如N-甲基四氫吡咯酮或N-辛基四氫吡咯酮)、脂肪酸之二甲基鹽胺類(譬如C₈-C₁₀脂肪酸二甲基鹽胺)及氯化烴類。EC產物可在添加至水中時自發性地乳化，以產生具有足夠安定性之乳化液，以允許經過適當設備噴洒施用。EW之製備係涉及無論是以液體(若其在室溫下不為液體，則其可在合

理之溫度下熔解，典型上係低於70°C)或在溶液中(經由使其溶於適當溶劑中)獲得式(1)化合物，然後使所形成之液體或溶液在高剪切下乳化於含有一或多種SFA之水中，以產生乳化液。供使用於EW之適當溶劑，包括植物油、氯化烴類(譬如氯苯類)、芳族溶劑(譬如烷基苯類或烷基萘類)及在水中具有低溶解度之其他適當有機溶劑。

微乳化液(ME)可經由使水和一或多種溶劑與一或多種SFA之摻合物混合而製成，以自發性地產生熱力學上安定之各向同性液體配方。式(1)化合物最初係存在於無論是水或溶劑 / SFA 摻合物中。供使用於ME之適當溶劑包括前文所述供使用於EC或EW中者。ME可為無論是油在水中型或水在油中型系統(何種系統存在，可藉由導電率度量法測得)，且可適合將水溶性與油溶性殺害劑混合在相同配方中。ME適合稀釋至水中，無論是保持微乳化液或形成習用油在水中型乳化液。

懸浮濃縮液(SC)可包括式(1)化合物之細分不溶性固體粒子之水性或非水性懸浮液。SC可經由將固體式(1)化合物在適當媒質中進行球或珠粒研磨而製成，視情況使用一或多種分散劑，以產生化合物之微細粒子懸浮液。一或多種潤濕劑可加入組合物中，且可加入懸浮劑，以降低粒子沉降之速率。或者，可將式(1)化合物乾磨，並添加至含前述作用劑之水中，以產生所要之最終產物。

氣溶膠配方係包含式(1)化合物與適當推進劑(例如正-丁烷)。亦可使式(1)化合物溶解或分散在適當媒質(例如水或水可

溶混液體，譬如正-丙醇)中，以提供使用於未經加壓、手動噴洒泵之組合物。

可將式(1)化合物以乾燥狀態與煙火混合物混合，以形成適合在包圍空間中產生含化合物煙霧之組合物。

膠囊懸浮液(CS)可以類似製備EW配方之方式製成，但使用另一個聚合階段，以致獲得油液滴之含水分散液，其中各油液滴係被聚合體殼層包覆，並含有式(1)化合物，及供其使用之選用載劑或稀釋劑。聚合體殼層可藉由無論是界面聚縮合反應或藉由凝聚程序製成。可提供此等組合物以供式(1)化合物之受控釋出，並其可用於種子處理。式(1)化合物亦可經調配在生物可降解之聚合體基質中，以提供化合物之緩慢受控釋出。

組合物可包含一或多種添加劑，以改良組合物之生物學性能(例如經由改良表面上之潤濕、滯留或分佈；經處理表面上之耐雨水性；或式(1)化合物之吸收或流動性)。此種添加劑包括表面活性劑、以油類為基料之噴霧添加劑，例如某些礦油或天然植物油類(譬如大豆與菜籽油)，及其與其他生物增強佐劑(可輔助或修改式(1)化合物作用之成份)之摻合物。

式(1)化合物亦可經調配作為種子處理劑使用，例如作成粉末組合物，包括乾燥種子處理用之粉末(DS)、水溶性粉末(SS)或漿液處理用之水可分散性粉末(WS)，或作成液體組合物，包括可流動濃縮液(FS)、溶液(LS)或膠囊懸浮液(CS)。DS、SS、WS、FS及LS組合物之製備係個別極類似上述DP、SP

、WP、SC及DC組合物。處理種子用之組合物可包含一種幫助組合物黏著至種子之作用劑(例如礦油或可形成薄膜之障壁)。

潤濕劑、分散劑及乳化劑可為陽離子性、陰離子性、兩性或非離子性類型之SFA。

陽離子性類型之適當SFA包括四級銨化合物(例如溴化鯨蠟基三甲基銨)、二氫咪唑類及胺鹽。

適當陰離子性SFA包括脂肪酸類之鹼金屬鹽、硫酸之脂族單酯類之鹽(例如月桂基硫酸鈉)、磺酸化芳族化合物之鹽(例如十二基苯磺酸鈉、十二基-苯磺酸鈣、丁基萘磺酸鹽及二-異丙基-與三-異丙基-萘磺酸鈉之混合物)、醚硫酸鹽、醇醚硫酸鹽(例如月桂乙基醚-3-硫酸鈉)、醚羧酸鹽(例如月桂乙基醚-3-羧酸鈉)、磷酸酯(得自一或多種脂肪醇與磷酸(主要為單-酯類)或五氧化二磷(主要為二-酯類)間之反應之產物,例如於月桂基醇與四磷酸間之反應;此外,此等產物可經乙氧基化)、磺酸基醯胺丁酸鹽、石蠟或烯烴磺酸鹽、牛磺酸鹽及木質磺酸鹽。

兩性類型之適當SFA包括甜菜鹼、丙酸酯及甘胺酸酯。

非離子性類型之適當SFA包括氧化烯類譬如環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物,與脂肪醇類(譬如油醇或鯨蠟醇)或與烷基酚類(譬如辛基酚、壬基酚或辛基甲酚)之縮合產物;衍生自長鏈脂肪酸類或己糖醇酐類之部份酯類;該部份酯類與環氧乙烷之縮合產物;嵌段聚合體(包括環氧乙烷與環氧丙烷);烷醇醯胺類;單純酯類(例如脂肪酸聚乙

二醇酯類)；胺氧化物(例如月桂基二甲胺氧化物)；及卵磷脂。

適當懸浮劑，包括親水性膠體(譬如多醣、聚乙烷基四氫吡咯酮或羧甲基纖維素鈉)及溶脹黏土(譬如膨土或鎂鋁海泡石)。

式(1)化合物可藉任何已知施用殺真菌化合物之方式施用。例如，其可經調配或未經調配，直接施用至植物之任何部份，包括葉、莖、樹枝或根部，至種植前之種子，或至植物正在生長或欲被種植之其他媒質(譬如圍繞根部之土壤、一般土壤、稻田水或水耕栽培系統)，或其可被噴洒，撒粉，藉浸漬施用，以乳膏或糊劑配方施用，以蒸氣施用，或經過組合物(譬如粒狀組合物或被裝填在水溶性袋中之組合物)之分佈或摻入土壤或含水環境中施用。

亦可將式(1)化合物注射至植物中，或使用電動態噴洒技術或其他低體積方法噴洒在草木上，或藉由陸地或空中灌溉系統施用。

作為含水製劑(水溶液或分散液)使用之組合物，一般係以含有高比例活性成份之濃縮液形式供應，該濃縮液係在使用之前添加至水中。此等濃縮液，其可包括DC、SC、EC、EW、ME、SG、SP、WP、WG及CS，經常需要忍受長時期儲存，而在此種儲存後，能夠添加至水中，以形成含水製劑，其仍然保持均勻歷經足夠時間，以使得彼等能夠藉習用噴洒設備施用。此種含水製劑可含有不同量之式(1)化合物(例如0.0001至10重量%)，依其欲被使用之目的而定。

式(1)化合物可以與肥料(例如含氮-、鉀-或磷-肥料)之混合物使用。適當配方類型包括肥料之顆粒。混合物適當地含有至高25重量%之式(1)化合物。

因此，本發明亦提供肥料組合物，其包含肥料與式(1)化合物。

本發明之組合物可含有具有生物學活性之其他化合物，例如微量營養物，或具有類似或補充殺真菌活性之化合物，或其具有植物生長調節、除草、殺昆蟲、殺線蟲或殺蟎活性。

藉由加入另一種殺真菌劑，所形成之組合物，相較於單獨之式(1)化合物，可具有較寬廣範圍之活性，或較大程度之內在活性。再者，另一種殺真菌劑可對式(1)化合物之殺真菌活性具有增效作用。

式(1)化合物可為組合物之單獨活性成份，或在適當情況下，其可與一或多種其他活性成份混合，譬如殺害劑、殺真菌劑、增效劑、除草劑或植物生長調節劑。另一種活性成份可：提供在一個地點具有較寬廣活性範圍或增加持久性之組合物；使式(1)化合物之活性增效或補充該活性(例如藉由增加作用之速度或克服拒斥性)；或幫助克服或預防對個別成份抗藥性之發展。特定其他活性成份將依組合物之意欲利用性而定。

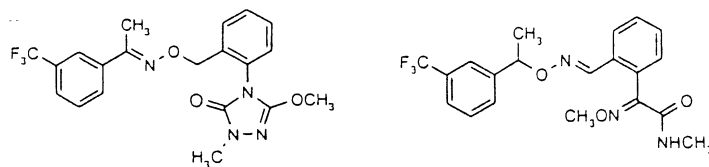
可被包含在本發明組合物中之殺真菌化合物之實例，為AC 382042(N-(1-氰基-1,2-二甲基丙基)-2-(2,4-二氯苯氧基)丙醯胺)、阿西苯唑拉(acibenzolar)-S-甲基、阿蘭尼卡巴(alanycarb)、阿

地莫夫 (aldimorph)、敵菌靈 (anilazine)、氮康唑 (azaconazole)、氮菲尼叮 (azafenidin)、氧偶氮史托賓 (azoxystrobin)、本那拉西 (benalaxyl)、苯菌靈 (benomyl)、苯噻伐卡巴 (benthiavalicarb)、比洛嘮唑 (biloxazol)、比特坦醇 (bitertanol)、殺稻瘟菌素 S、玻斯卡利得 (boscalid)(新名稱尼可必吩 (nicobifen))、溴母康唑 (bromuconazole)、布吡美特 (bupirimate)、卡普塔弗 (captafol)、克菌丹 (captan)、多菌靈 (carbendazim)、多菌靈氫氯酸鹽、萎銹靈 (carboxin)、卡丙醯胺 (carpropamid)、萬萆酮、CGA 41396、CGA 41397、喹啉甲二磺酸鹽 (chinomethionate)、氯苯并噻𪔐 (chlorbenzthiazone)、百菌清 (chlorothalonil)、氯唑啉鹽 (chlorozolate)、可洛吉拉肯 (clozylacon)、含銅化合物，譬如氧氯化銅、氧喹啉化銅、硫酸銅、松油酸銅及波爾多混合物，西醯胺偶氮磺醯胺 (cyamidazosulfamid)、西偶氮發醯胺 (cyazofamid)(IKf-916)、西弗吩醯胺 (cyflufenamid)、西莫山尼 (cymoxanil)、西普洛康唑 (cyproconazole)、賽普洛的尼 (cyprodinil)、迪巴卡巴 (debacarb)、二-2-吡啶基二硫化物 1,1'-二氧化物、二氯弗尼得 (dichlofluanid)、二氯西美特 (diclocymet)、二氯美井 (diclomezin)、氯硝胺 (dicloran)、二乙吩卡巴 (diethofencarb)、二吩康唑 (difenconazole)、二吩坐奎 (difenzoquat)、二氟美托林 (diflumetorim)、硫代磷酸 O,O-二-異丙基-S-苄酯、二甲氟唑 (dimefluazole)、二甲康唑 (dimetconazole)、二甲利莫 (dimethirimol)、二甲嗎福 (dimethomorph)、二氧史托賓 (dimoxystrobin)、二尼康唑 (diniconazole)、敵蟎普 (dinocap)、二噻農 (dithianon)、氯化十二基二甲基銨、多地嗎福 (dodemorph)、多果定 (dodine)、多胍啉 (doguadine)、克瘟散 (edifenphos)、環

氧康唑(epoxiconazole)、乙沙巴克薩(ethaboxam)、乙菌定(ethirimol)
 、(Z)-N-苄基-N([甲基(甲基-硫基亞乙基胺氧基羰基)胺基]硫基)
)-β-丙胺酸乙酯、乙利二唑(etridiazole)、發姆氧酮(famoxadone)
 、吩醯胺酮(fenamidone)、吩阿利莫(fenarimol)、吩布康唑
 (fenbuconazole)、吩夫蘭(fenfuram)、吩己醯胺(fenhexamid)、芬氧
 尼耳(fenoxanil)(AC382042)、吩吡若尼(fenpiclonil)、吩丙啉
 (fenpropidin)、吩丙嗎福(fenpropimorph)、薯瘟錫醋酸鹽(fentin acetate)
 、毒菌錫(fentin hydroxide)、福美鐵(ferbam)、福林宗(ferimzone)
 、氟阿吉南(fluzinam)、氟二氧尼(fludioxonil)、氟甲托勃
 (flumetover)、弗嗎福(flumorph)、氟基醯亞胺、氟氧史托賓
 (fluoxastrobin)、氟昆康唑(flquinconazole)、氟矽氮唑(flusilazole)
 、氟胺基磺酸(flusulfamide)、氟托拉尼(flutolanil)、氟三阿弗
 (flutriafol)、滅菌丹(folpet)、弗謝替(fosetyl)-鋁、福伯利答唑
 (fuberidazole)、福瑞拉西(furalaxyl)、弗拉美吡(furametpyr)、雙胍
 鹽(guazatine)、六康唑(hexaconazole)、羥基異噁唑、海美沙唑
 (hymexazol)、衣馬雜利(imazalil)、衣米苯康唑(imibenconazole)、
 亞胺辛叮(iminoctadine)、亞胺辛叮(iminoctadine)三醋酸鹽、愛普
 康唑(ipconazole)、衣普洛苯弗斯(iprobenfos)、衣普洛二酮(iprodione)
 、依普洛維利卡巴(iprovalicarb)、丁基胺基甲酸異丙酯、富士
 一號(isoprothiolane)、春日霉素、可列索克辛(kresoxim)-甲基、
 LY186054、LY211795、LY248908、代森錳鋅(mancozeb)、代森錳
 (maneb)、美吩諾克山(mefenoxam)、美帕尼吡林(mepanipyrin)、
 美若尼(mepronil)、美塔拉西(metalaxyl)、美塔拉西(metalaxyl) M
 、美特康唑(metconazole)、代森聯(metiram)、代森聯(metiram)-鋅

、美托明史托賓 (metominostrobin)、美托吩酮 (metrafenone)、
 MON65500 (N-烯丙基-4,5-二甲基-2-三甲基矽烷基噻吩-3-羧醯胺)、
 麥可洛丁尼 (myclobutanil)、NTN0301、新阿索吡 (neoasozin)、
 二甲基二硫胺基甲酸鎳、硝基鉍 (nitrothal)-異丙基、努阿利莫
 (nuarimol)、歐福瑞斯 (ofurace)、有機汞化合物、歐瑞沙史托賓
 (orysastrobin)、氧二西 (oxadixyl)、氧硫弗隆 (oxasulfuron)、嘧啉酸
 、歐克波康唑 (oxpoconazole)、氧化萎銹靈 (oxycarboxin)、皮福拉
 唑鹽 (pefurazoate)、平康唑 (penconazole)、平西古隆 (pencycuron)、
 吩吡 (phenazin) 氧化物、磷酸、鄰苯二甲內酯、皮可氧史托賓
 (picoxystrobin)、多氧菌素 (polyoxin) D、波利蘭 (polyram)、噻菌靈
 (probenazole)、普洛氯來滋 (prochloraz)、普洛西米酮 (procymidone)
 、普洛帕莫卡巴 (propamocarb)、普洛帕莫卡巴 (propamocarb) 鹽酸
 鹽、普洛皮康唑 (propiconazole)、甲基代森鋅 (propineb)、丙酸、
 普洛喹那得 (proquinazid)、丙硫康唑 (prothioconazole)、皮拉可洛
 史托賓 (pyraclostrobin)、定菌磷 (pyrazophos)、吡啶吩諾斯 (pyrifenox)
 、吡啶美沙尼 (pyrimethanil)、吡咯昆隆 (pyroquilon)、吡氧呋
 (pyroxyfur)、硝吡咯菌素、四級銨化合物、殺蟎猛 (quinomethionate)
 、奎氧吩 (quinoxifen)、五氯硝基苯 (quintozene)、矽硫法姆
 (silthiofam)(MON 65500)、S-衣馬雜利 (imazalil)、西美康唑
 (simeconazole)、西普康唑 (sipconazole)、五氯苯酚鈉、螺氧胺
 (spiroxamine)、鏈霉素、硫磺、提布康唑 (tebuconazole)、提可若
 弗塔蘭 (tecloftalam)、提可那井 (tecnazene)、四康唑 (tetraconazole)
 、噻苯咪唑 (thiabendazole)、噻氟醯胺 (thi fluzamide)、2-(硫氰基甲
 硫基)苯并噻唑、甲基托布津 (thiophanate-methyl)、福美雙 (thiram)

、提阿地尼 (tiadinil)、提米苯康唑 (timibenconazole)、托可洛弗斯 (tolclofos)-甲基、對甲抑菌靈 (tolylfluanid)、三阿地美風 (triadimefon)、三阿地孟醇 (triadimenol)、三吉布提爾 (triazbutil)、三唑氧 (triazoxide)、三環唑 (tricyclazole)、克啉菌 (tridemorph)、三氟氧史托賓 (trifloxystrobin)、三氟米唑 (triflumizole)、吡胺靈 (triforine)、三替康唑 (triticonazole)、有效霉素 A、發巴姆 (vapam)、賓可若左林 (vinclozolin)、XRD-563、代森鋅 (zineb)、福美鋅 (ziram)、坐克沙醯胺 (zoxamide)，及下式化合物：



式(1)化合物可與土壤、泥煤或其他固定介質混合，以保護植物抵抗種子所帶有、土壤所帶有或葉部真菌疾病。

一些混合物可包含具有顯著不同物理、化學或生物學性質之活性成份，以致其不容易適合於相同習用配方類型。在此等情況下，可製備其他配方類型。例如，在一種活性成份為水不溶性固體，而另一種為水不溶性液體之情況下，雖然如此，亦能夠使各活性成份分散於相同連續水相中，其方式是使固體活性成份以懸浮液分散(使用類似SC之製備)，但使液體活性成份以乳化液分散(使用類似EW之製備)。所形成之組合物為懸浮乳化液(SE)配方。

【實施方式】

藉下述實例說明本發明，其中係使用下列縮寫：

ml = 毫升

DMSO = 二甲亞砜

g = 克

NMR = 核磁共振

ppm = 每百萬份之份數

HPLC = 高性能液相層析

 M^+ = 質量離子

s = 單重峰

q = 四重峰

d = 雙重峰

m = 多重峰

br s = 寬廣單峰

ppm = 每百萬份之份數

t = 三重峰

m.p. = 熔點

實例 1

此實例係說明 2-(6-喹啉基氧基)-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁鹽胺(表 1 之化合物編號 2) 之製備

階段 1：2-溴-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁鹽胺之製備

步驟 1：4-胺基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽之製備

使 3-胺基-3-甲基丁炔(可以 90% 水溶液市購而得；16.6 克)溶於二氯甲烷(150 毫升)中，以硫酸鈉脫水乾燥，並過濾，而得含有 14.9 克胺之溶液。於胺之經攪拌溶液中，在氮大氣及環境溫度下，添加無水三乙胺(48.4 毫升)。然後逐滴添加二氯甲烷(100 毫升)中之 1,2-雙-(氯基二甲基矽烷基)乙烷(38.98 克)，藉由冷卻將反應溫度保持在 15°C 下。將混合物攪拌 3 小時，自溶液濾出在反應期間形成之無色固體，並於減壓下蒸發濾液，獲得糊狀物。將此糊狀物在己烷中萃取，及再過濾。於減壓下蒸發濾液，並蒸餾所獲得之油，獲得 1-(1,1-二甲基-2-丙炔基)-2,2,5,5-四甲基-1-氮-2,5-二矽環戊烷，21.5 克，沸點 41°C，在 0.06 毫米 Hg 壓力下。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.16 (12H, s); 0.60 (4H, s); 1.48 (6H, s); 2.24 (1H, s).

步驟 2

於氮大氣下，使得自步驟 1 之產物 (13.0 克) 在無水四氫呋喃 (140 毫升) 中冷卻至 -70°C ，並攪拌，及在 5 分鐘期間，於 -65 至 -70°C 下，添加正 - 丁基鋰溶液 (23.1 毫升，在己烷中之 2.5 M 溶液)。使混合物溫熱至 -5°C ，並於 10 分鐘內，逐滴添加碘化甲烷 (3.93 毫升)。當放熱反應發生時，使反應混合物溫熱至 10°C 。經由冷卻 2 小時，將混合物保持在 20°C 下，然後在減壓下蒸發至小體積。使殘留物溶於己烷中，過濾以移除不溶性物質，及在減壓下蒸發，而得 1-(1,1-二甲基-2-丁炔基)-2,2,5,5-四甲基-1-氮-2,5-二矽環戊烷，為黃色油，13.0 克。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.10 (12H, s); 0.56 (4H, s); 1.40 (6H, s); 1.72 (3H, s).

步驟 3

將得自步驟 2 之產物 (13.0 克) 於 0°C 下慢慢添加至鹽酸水溶液 (35 毫升，4M) 中，並攪拌。將所形成之乳化液攪拌 0.5 小時，然後以氫氧化鈉水溶液 (4M) 帶至 pH 14，同時藉由在冰中冷卻，使反應混合物保持在 0°C 下。將含水混合物在二氯甲烷中萃取 (三次)，並使合併之萃液以硫酸鈉脫水乾燥，及過濾。藉由添加過量氯化氫在 1,4-二氧陸園中之飽和溶液，使濾液呈酸性。於減壓下使混合物濃縮，直到形成無色沉澱物為止。將己烷添加至此懸浮液中，並自溶液濾出固體。將固體以無水乙醚洗滌，並放置在真空下，以移除任何殘留溶劑，獲得所需要之產物，為無色固體 5.0 克。

$^1\text{H NMR}$ ($\text{d}_6\text{-DMSO}$) δ : 1.74 (6H, s); 1.82 (3H, s); 8.74 (3H, br s).

步驟 4: 2-溴-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺之製備

使得自步驟3之產物(5.0克)溶於無水二氯甲烷(200毫升)中，冷卻至3°C，並攪拌，然後添加溴化2-溴基丁鹽(6.25克)，接著逐滴添加無水三乙胺(10.93毫升)，將反應物保持在5°C下。將在反應期間形成之懸浮液於環境溫度下攪拌1小時，然後添加水。分離有機相，以水洗滌，以硫酸鎂脫水乾燥，接著在減壓下蒸發。使殘留物藉層析(矽膠；己烷/乙醚3：1體積比)分級分離，而得所需要之產物，5.2克，為無色固體，熔點79-81°C。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.04 (3H, t); 1.64 (6H, s); 1.84 (3H, s); 2.04-2.18 (2H, m); 4.20-4.24 (1H, m); 6.46 (1H, br s).

階段2

於氮大氣及環境溫度下，將無水N,N-二甲基甲醯胺(10毫升)中之6-羥基喹啉(0.46克)逐滴添加至氫化鈉(0.10克，在礦油中之80%分散液)在無水N,N-二甲基甲醯胺中之經攪拌懸浮液內。將此綠色溶液於環境溫度下攪拌1小時，並添加2-溴-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺(0.74克)在無水N,N-二甲基甲醯胺(10毫升)中之溶液。將混合物於環境溫度下攪拌18小時，倒入水中，並在乙醚中萃取(三次)。將有機萃液合併，以稀氫氧化鈉水溶液、水(兩次)洗滌，以硫酸鎂脫水乾燥，及在減壓下蒸發，獲得膠質。使此膠質藉層析(矽膠；乙醚)分級分離，而得所需要之產物0.44克，為無色膠質。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.06-1.10 (3H, t); 1.56-1.60 (6H, d); 1.76 (3H, s); 1.98-2.10 (2H, m); 4.54-4.58 (1H, m); 6.42 (1H, s); 7.10 (1H, m); 7.36-7.44 (2H, m); 8.02-8.06 (2H, m); 8.82 (1H, d).

實例 2

此實例係說明 2-(6-喹啉基氧基)-N-(1-第三-丁基二-甲基矽烷基氧基-4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺(表 1 之化合物編號 50)之製備

階段 1：4-胺基-1-羥基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽之製備步驟 1

於氮大氣下，使 1-(1,1-二甲基-2-丙炔基)-2,2,5,5-四甲基-1-氮-2,5-二矽環戊烷(22.6 克)在無水四氫呋喃(250 毫升)中冷卻至 -50°C ，並攪拌，且在 10 分鐘內，逐滴添加正-丁基鋰溶液(44 毫升，在己烷中之 2.5 M 溶液)。將混合物攪拌 0.5 小時，使其溫熱至 -20°C ，然後使甲醛氣體起泡經過混合物，直到當藉 GLC 分析測定時，無起始物質殘留為止。於反應完成時，將混合物以水處理，分離醚相，並以醋酸乙酯萃取(兩次)水相。將有機萃液合併，以水洗滌(三次)，以硫酸鎂脫水乾燥，及在減壓下蒸發，獲得所需要之產物(24.96 克)，為淡黃色液體。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.00 (12H, s); 0.46 (4H, s); 1.32 (6H, s); 4.10 (2H, s).

步驟 2

將得自步驟 1 之產物(24.96 克)以稀鹽酸水溶液(300 毫升)處理，並於環境溫度下攪拌 0.5 小時。將混合物以乙醚洗滌(兩次)，於減壓下蒸發水相，與甲苯一起蒸餾(兩次)以移除殘留水，並以己烷研製所獲得之殘留固體，而得 4-胺基-1-羥基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽(13.1 克)，為乳黃色固體。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.48 (6H, s); 4.06 (2H, s); 5.32 (1H, s); 8.64 (3H, s).

階段 2：4-胺基-1-第三-丁基二甲基矽烷基氧基-4-甲基戊-2-炔

之製備

使 4-氨基-1-羥基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽(4.40 克)溶於無水 N,N-二甲基甲醯胺(100 毫升)中，並添加三乙胺(4.44 毫升)。將此懸浮液於環境溫度下攪拌 10 分鐘，添加咪唑(4.93 克)，接著是無水 N,N-二甲基甲醯胺(40 毫升)中之氯化第三-丁基二甲基矽烷(5.24 克)。將混合物於環境溫度下攪拌 18 小時，然後以水稀釋。以乙醚萃取(三次)混合物，並將有機萃液合併，以水洗滌(兩次)，接著以硫酸鎂脫水乾燥，及在減壓下蒸發，獲得所需要之產物(6.88 克)，為黃色液體。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.04 (6H, s); 0.84 (9H, s); 1.30 (6H, s); 4.22 (2H, s).

階段 3: 2-(6-喹啉基氧基)丁酸之製備步驟 1: 2-(6-喹啉基氧基)丁酸甲酯之製備

將 6-羥基喹啉(25.1 克)、2-溴基丁酸甲酯(32.3 克)及無水碳酸鉀(23.0 克)在無水 N,N-二甲基甲醯胺(100 毫升)中，於 100°C 下攪拌 3 小時，然後在環境溫度下儲存 18 小時。將混合物添加至水中，以醋酸乙酯萃取(三次)，並將合併之萃液以水洗滌(四次)，接著以硫酸鎂脫水乾燥。於減壓下蒸發溶劑，而得所需要之產物(39.0 克)，為紅色油。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.10-1.14 (3H, t); 2.04-2.12 (2H, q); 3.78 (3H, s); 4.72-4.76 (1H, t); 7.00 (1H, d); 7.36-7.40 (1H, m); 7.42-7.46 (1H, m); 8.02-8.04 (2H, d); 8.80 (1H, d).

步驟 2: 2-(6-喹啉基氧基)丁酸之製備

將得自步驟 1 之產物(38.8 克)在氫氧化鈉(12.6 克)於水(100 毫升)中之溶液內攪拌，並加熱至 90°C，歷經 3 小時，然後冷卻

至環境溫度。以水稀釋此溶液，並將水相以醋酸乙酯洗滌(兩次)，以鹽酸水溶液酸化至pH值6，接著以醋酸乙酯萃取(三次)。將萃液合併，以硫酸鎂脫水乾燥，並於減壓下蒸發溶劑，且以己烷洗滌殘留物，獲得所需要之產物，8.1克，為黃褐色固體。將水相以醋酸乙酯再萃取，並按前述方式處理，提供其他所需要之產物(3.7克)。

階段4

將2-(6-喹啉基氧基)丁酸(0.61克)、4-胺基-1-第三-丁基二甲基矽烷基氧基-4-甲基戊-2-炔(0.57克)及4-二甲胺基吡啶(0.010克)在無水二氯甲烷(10毫升)中攪拌，並添加N-(3-二甲胺基丙基)-N'-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽(0.53克)。將混合物於環境溫度下攪拌3.5小時，儲存2天，以二氯甲烷稀釋，以飽和碳酸氫鈉水溶液洗滌(兩次)，然後以水洗滌。使有機相以硫酸鎂脫水乾燥，並於減壓下蒸發，而得黃色油。使此油藉層析(矽膠；己烷/醋酸乙酯3:1體積比)分級分離，獲得膠，將其以己烷研製，而得所需要之產物(0.12克)，為無色固體，熔點78-80°C。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 0.08 (6H, s); 0.88 (9H, s); 1.06-1.10 (3H, t); 1.62-1.66 (6H, d); 2.00-2.10 (2H, m); 4.28 (2H, s); 4.54-4.58 (1H, t); 6.44 (1H, s); 7.10 (1H, s); 7.36-7.44 (2H, m); 8.02-8.06 (2H, d); 8.80 (1H, m).

使己烷洗液於減壓下蒸發，而得油狀物(0.53克)，其含有其他所需要之產物。

實例3

此實例係說明2-(6-喹啉基氧基)-N-(1-羥基-4-甲基戊-2-炔-4-基)

丁醯胺(表1化合物之編號10)之製備

將2-(6-喹啉基氧基)-N-(1-第三丁基二甲基矽烷基氧基-4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺(0.58克)在四氫呋喃(10毫升)中，於3-5°C下攪拌，並在5分鐘內，逐滴添加氟化四正-丁基銨溶液(2.64毫升，在四氫呋喃中之1M溶液)。於添加完成時，將混合物於0°C下攪拌0.5小時，在環境溫度下0.75小時，然後儲存18小時。於減壓下蒸發溶劑，並使殘留物在醋酸乙酯與氯化銨水溶液之間作分液處理。分離有機相，以氯化銨水溶液、鹽水洗滌，以硫酸鎂脫水乾燥，及在減壓下蒸發，獲得膠質，使其藉層析(矽膠；己烷/醋酸乙酯，1:2體積比)分級分離，而得所需要之產物，為無色玻璃(0.30克)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.06-1.10 (3H, t); 1.58 (3H, s); 1.60 (3H, s); 1.98-2.08 (3H, m); 4.22-4.24 (2H, d); 4.56-4.60 (1H, t); 6.42 (1H, s); 7.10 (1H, s); 7.36-7.44 (2H, m); 8.04-8.08 (2H, d); 8.80 (1H, m).

實例4

此實例係說明2-(6-喹啉基氧基)-N-(1-甲氧基-4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺(表1之化合物編號12)之製備

步驟1: 4-胺基-1-甲氧基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽之製備

於氫化鈉(0.45克，在礦油中之80%分散液)在無水N,N-二甲基甲醯胺(2毫升)中之經攪拌懸浮液內，在氮大氣及環境溫度下，於5分鐘內，逐滴添加4-胺基-1-羥基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽(0.75克)在無水N,N-二甲基甲醯胺(20毫升)中之溶液。將混合物於環境溫度下攪拌2.75小時，然後添加碘化甲烷(0.78克)在N,N-二甲基甲醯胺(5毫升)中之溶液。將反應物攪拌2.5

小時，儲存 18 小時，然後倒入水中，以乙醚萃取（三次），並合併有機萃液。將合併之有機相以稀鹽酸萃取（三次），並將含水酸性萃液合併，及在減壓下蒸發。於減壓下經由與甲苯一起蒸發（兩次）使殘留固體乾燥，獲得黃色膠（0.8 克），含有所需要之產物。化合物係自其 NMR 光譜進行特徵鑒定。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.78 (6H, s); 3.40 (3H, s); 4.12 (2H, s); 8.90 (3H, br s).

步驟 2

將三乙胺（0.54 毫升）添加至得自步驟 1 之產物（0.8 克）在無水 N,N-二甲基甲醯胺（10 毫升）中之經攪拌溶液內。將溶液攪拌 5 分鐘，然後添加無水 N,N-二甲基甲醯胺（5 毫升）中之 1-羥基苯并三唑（0.39 克）與 N-(3-二甲胺基丙基)-N'-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽（0.55 克）。將混合物於環境溫度下攪拌 2 小時，倒入水中，並以醋酸乙酯萃取（三次）水相。將有機萃液合併，以水洗滌（三次），以硫酸鎂脫水乾燥，及在減壓下蒸發，而得紅色油。使此油藉層析（矽膠；醋酸乙酯）分級分離，獲得所需要之產物（0.15 克），為淡黃色膠質。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.06-1.12 (3H, t); 1.62 (6H, s); 2.00-2.08 (2H, m); 3.32 (3H, s); 4.08-4.24 (2H, s); 4.58-4.62 (1H, t); 6.44 (1H, s); 7.10 (1H, m); 7.36-7.46 (2H, m); 8.04-8.08 (2H, d); 8.82 (1H, m).

實例 5

此實例係說明 2-(6-喹啉基氧基)-2-(乙氧基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)乙醯胺（表 17 之化合物編號 2）之製備

步驟 1：2-(6-喹啉基氧基)-2-(乙氧基)醋酸乙酯之製備

使第三-丁醇鉀(3.15克)溶於第三-丁基醇(20毫升)中，並在環境溫度下攪拌10分鐘。添加6-羥基喹啉(3.0克)，將所形成之深綠色溶液攪拌15分鐘，然後添加2-氯基-2-乙氧基醋酸乙酯(4.22克，90%純)，接著是催化量之碘化鉀(0.005克)。將混合物攪拌18小時，倒入水中，並以氯仿萃取。將有機離份以鹽水、水洗滌，並以硫酸鎂脫水乾燥。蒸發溶劑，而得褐色油，使其在矽膠上藉急驟式層析純化，以醋酸乙酯：己烷之梯度液(1：2至4：1)溶離，獲得2-(6-喹啉基氧基)-2-(乙氧基)醋酸乙酯，為淡褐色油(3.68克)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.28 (3H, t); 1.31 (3H, t); 3.79 (1H, m); 3.90 (1H, m); 4.31 (2H, q); 5.68 (1H, s); 7.38 (2H, dd); 7.51 (1H, dd); 8.06 (2H, dd); 8.32 (1H, dd).

步驟2：2-(6-喹啉基氧基)-2-(乙氧基)醋酸之製備

將2-(6-喹啉基氧基)-2-(乙氧基)醋酸乙酯(3.68克)添加至氫氧化鈉(0.589克)在水(10毫升)與甲醇(30毫升)中之溶液內，並攪拌5分鐘。於減壓下蒸發溶液，添加水，並以醋酸乙酯洗滌水相。以鹽酸使水相酸化，並以醋酸乙酯萃取。將萃液合併，以硫酸鎂脫水乾燥，及在減壓下蒸發，而得2-(6-喹啉基氧基)-2-(乙氧基)醋酸(1.47克)，為乳黃色固體。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.33 (3H, t); 3.98 (1H, m); 5.71 (1H, s); 7.44 (1H, dd); 7.52 (2H, m); 8.05 (1H, d); 8.20 (1H, d); 8.84 (1H, dd).

步驟3

將三乙胺(0.3毫升)添加至4-胺基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽(0.054克)在N,N-二甲基甲醯胺(2毫升)中之經攪拌溶液內，獲得白

色懸浮液。添加 2-(6-喹啉并)-2-(乙氧基)醋酸 (0.1 克)，接著是 N-(3-二甲胺基丙基)-N'-乙基碳化二亞胺鹽酸鹽 (0.077 克) 與催化量之 1-羥基苯并三唑 (0.005 克)，並將白色懸浮液於環境溫度下攪拌 18 小時。添加水，並以醋酸乙酯萃取水相。將有機相以水、飽和碳酸氫鈉水溶液及鹽水洗滌，以硫酸鎂脫水乾燥，及在減壓下蒸發，獲得黃色油 (0.117 克)。使此油藉急驟式層析 (矽膠；醋酸乙酯 / 己烷 1:1 體積比) 純化，獲得所需要之產物 (0.096 克)，為無色油。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ ppm: 1.28 (3H, t); 1.64 (3H, s); 1.66 (3H, s); 1.80 (3H, s); 3.70 (1H, m); 3.88 (1H, m); 5.48 (1H, s); 6.79 (1H, bs); 7.37 (1H, dd); 7.49 (1H, d); 7.52 (1H, dd); 8.05 (1H, d); 8.08 (1H, d); 8.82 (1H, dd).

實例 6

此實例係說明 2-(6-喹啉基氧基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)-3-甲氧基丙醯胺 (表 11 之化合物編號 2) 之製備

階段 1: 2-溴-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)-3-甲氧基丙醯胺之製備

步驟 1: 2-溴基-3-甲氧基丙酸甲酯之製備

使 2,3-二溴基丙酸甲酯 (21.9 克) 與三甲胺 N-氧化物 (0.1 克) 在甲醇 (8 毫升) 中冷卻至 -5°C ，並於氮大氣下攪拌。於 15 分鐘內，將剛製自鈉 (2.25 克) 與甲醇 (24 毫升) 之甲醇鈉之甲醇性溶液，逐滴添加至混合物中，藉由冷卻使其保持低於 0°C 。於添加完成時，將混合物再攪拌 30 分鐘，然後添加醋酸 (1 毫升)，接著是乙醚 (100 毫升)。過濾混合物以移除不溶性鹽，並於減壓下蒸發濾液，而得油狀物，使其再溶於小體積乙醚中，及再過濾。於減壓下蒸發濾液，獲得所需要之產物 (17.4

克)，為淡黃色油。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 3.41 (3H, s); 3.74 (1H, dd); 3.82 (3H, s); 3.92 (1H, dd); 4.34 (1H, dd).

步驟 2：2-溴基-3-甲氧基丙酸之製備

將 2-溴基-3-甲氧基丙酸甲酯 (1.00 克) 在四氫呋喃 (8 毫升) 中，於 10°C 下攪拌，並逐滴添加水 (1.5 毫升) 中之氫氧化鋰單水合物 (0.21 克)。於添加完成時，將混合物攪拌 1.5 小時，使無色溶液於減壓下蒸發至小體積，然後，以稀硫酸將水溶液帶至 pH 值 3。將混合物以乙醚 (50 毫升) 萃取，並分離有機相，以鹽水洗滌，以硫酸鎂脫水乾燥，接著於減壓下蒸發，獲得所需要之產物 (0.6 克)，為無色液體。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 3.45 (3H, s); 3.78 (1H, m); 3.92 (1H, m); 4.38 (1H, m); 6.65 (1H, br s).

步驟 3：2-溴-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)3-甲氧基丙醯胺之製備

使 2-溴基-3-甲氧基丙酸 (0.366 克) 溶於含有無水 N,N-二甲基甲醯胺 (0.05 毫升) 之無水二氯-甲烷 (4 毫升) 中，並攪拌，及添加氯化草醯 (0.254 克)。將混合物於環境溫度下攪拌 2 小時，然後在減壓下蒸發，而得氯化 2-溴基-3-甲氧基丙醯 ($\text{C}=\text{O}$, ν 1780 cm^{-1})。使氯化醯溶於無水二氯甲烷 (6 毫升) 中，並添加 4-胺基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽 (0.267 克)，接著使混合物冷卻至 3°C ，及逐滴添加三乙胺 (0.404 克)，保持反應溫度在 $0-5^\circ\text{C}$ 之間。將已形成之懸浮液於環境溫度下攪拌 1 小時，以另外之二氯甲烷稀釋，以鹽酸 (2M) 洗滌，並分離有機相，以硫酸鎂脫水乾燥，然後在減壓下蒸發，獲得膠質。使此膠質藉層析 (

矽膠：己烷 / 醋酸乙酯，3：2 體積比) 分級分離，獲得所需要之產物(0.3 克)，為無色固體。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.63 (6H, s); 1.82 (3H, s); 3.44 (3H, s); 3.88 (2H, m); 4.32 (1H, m); 6.62 (1H, s).

階段 2

將 6-羥基喹啉(0.083 克)、無水碳酸鉀(0.087 克)及 2-溴-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)3-甲氧基丙醯胺(0.150 克)在無水 N,N-二甲基甲醯胺(3 毫升)中攪拌，並加熱至 80°C，歷經 5 小時，然後於環境溫度下儲存 72 小時。將黃色懸浮液以水稀釋，以醋酸乙酯萃取，並分離有機相，然後以水洗滌，以硫酸鎂脫水乾燥，及在減壓下蒸發成膠質。使此膠質藉層析(矽膠；醋酸乙酯：己烷，3：2 體積比)分級分離，獲得所需要之產物(0.055 克)，為無色膠質。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.58 (3H, s); 1.60 (3H, s); 1.78 (3H, s); 3.46 (3H, s); 3.95 (2H, m); 4.78 (1H, m); 6.60 (1H, s); 7.18 (1H, m); 7.40 (1H, m); 7.50 (1H, m); 8.08 (2H, m); 8.83 (1H, m).

實例 7

此實例係說明 2-(6-喹啉氧基)-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺(表 20 之化合物編號 2)之製備

使 6-羥基喹啉(0.060 克，按 *J. Chem. Soc.* (1952), 4985 中所述製成)與 2-溴-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺(0.101 克)溶於含有無水碳酸鉀(0.088 克)之無水 N,N-二甲基甲醯胺(2 毫升)中。攪拌混合物，並加熱至 80°C，歷經 5 小時，然後使其冷卻至環境溫度，並儲存 18 小時。將褐色懸浮液以水稀釋，在醋酸乙

酯中萃取，並分離有機相，以水洗滌，以硫酸鎂脫水乾燥，及在減壓下蒸發，獲得淡褐色油。使此油藉層析(矽膠；醋酸乙酯 / 己烷，4：1體積比)分級分離，獲得標題產物(0.12克)，為淡褐色膠質。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.04 (3H, t); 1.53 (6H, s); 1.72 (3H, s); 1.95-2.05 (2H, m); 4.54 (1H, m); 6.30 (1H, s); 7.14 (1H, m); 7.60 (1H, dd); 7.97 (1H, d); 9.20 (1H, s); 9.25 (1H, s).

實例 8

以類似實例 1 之程序，使 7-羥基異喹啉(市購可得)與 2-溴-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺反應，獲得 2-(7-異喹啉基氧基)-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺(表 39 之化合物編號 2)，為無色固體，熔點 149-150°C。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.08 (3H, t); 1.58 (3H, s); 1.59 (3H, s); 1.77 (3H, s); 1.98-2.12 (2H, m); 4.58 (1H, m); 6.40 (1H, s); 7.26 (1H, d); 7.42 (1H, dd); 7.61 (1H, d); 7.79 (1H, d); 8.45 (1H, d); 9.14 (1H, s).

實例 9

以類似實例 6 之程序，使 7-羥基異喹啉(市購可得)與 2-溴-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)-3-甲氧基丙醯胺反應，而得 2-(7-異喹啉基氧基)-N-(2-甲基戊-3-炔-2-基)-3-甲氧基丙醯胺(表 49 之化合物編號 2)，為無色固體，熔點 155-156°C。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.59 (3H, s); 1.60 (3H, s); 1.77 (3H, s); 3.45 (3H, s); 3.88-3.96 (2H, m); 4.78 (1H, m); 6.54 (1H, s); 7.31 (1H, d); 7.47 (1H, dd); 7.61 (1H, d); 7.80 (1H, d); 8.46 (1H, d); 9.14 (1H, s).

實例 10

此實例係說明 2-(3-溴基-6-喹啉基氧基)-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺(表 77 之化合物編號 2)與 2-(3,8-二溴基-6-喹啉基氧基)-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺(表 115 之化合物編號 2)之製備

階段 1：3-溴基-6-羥基喹啉與 3,8-二溴基-6-羥基-喹啉之製備

步驟 1：3-溴基-6-硝基喹啉與 3,8-二溴基-6-硝基喹啉之製備

在以 *Liebigs Ann Chem*, (1966), 98-106 中所述之程序製造 3-溴基-6-硝基喹啉之修正法中，將 6-硝基喹啉(5.5 克)在含有吡啶(5.0 克)之四氯化碳(200 毫升)中，以溴(15.3 克)處理，並加熱至回流，直到所有 6-硝基喹啉已被反應為止。使反應混合物冷卻至環境溫度，儲存 18 小時，然後於氯仿與鹽酸(2M)之間作分液處理。過濾混合物，並分離有機相，以飽和碳酸氫鈉水溶液洗滌，以硫酸鎂脫水乾燥，接著在減壓下蒸發，而得淡黃色固體。使固體自冰醋酸再結晶，獲得含有 3-溴基-6-硝基喹啉(4 份)與 3,8-二溴基-6-硝基喹啉(1 部份)之混合物，為淡黃色固體(4.06 克)。

步驟 2：6-胺基-3-溴基喹啉與 6-胺基-3,8-二溴基喹啉之製備

於環境溫度下，使得自步驟 1 之產物(4.0 克)懸浮於丙-2-醇(15 毫升)、水(8 毫升)及濃鹽酸(0.5 毫升)之混合物中並攪拌。於混合物中分次添加鐵粉(6.0 克)，造成放熱反應，產生深紅色懸浮液。使此懸浮液冷卻至環境溫度，萃取於鹽酸水溶液(2M)中，過濾，並以乙醚洗滌。分離含水酸性相，以氫氧化鈉水溶液(2M)使其呈鹼性，並以醋酸乙酯萃取(兩次)所製成之濃稠沉澱物。將萃液合併，以鹽水洗滌，然後以硫酸鎂脫水乾燥，及在減壓下蒸發，而得淡褐色固體。使

固體藉層析(矽膠)分級分離，首先以二氯甲烷溶離，提供6-胺基-3,8-二溴基喹啉，0.15克(MH⁺ 301，2x Br)，接著以己烷 / 醋酸乙酯(1：1體積比)溶離，獲得6-胺基-3-溴基喹啉，1.0克，熔點151-2°C (MH⁺ 223，1x Br)。

步驟3：3,8-二溴基-6-羥基喹啉之製備

使6-胺基-3,8-二溴基喹啉(0.15克)懸浮於磷酸(75%，11毫升)中，並在密封玻璃管中，於180°C下加熱72小時。使混合物冷卻至環境溫度，以冰(50毫升)稀釋，並以氫氧化鈉水溶液(4M)帶至pH值2。將所形成之褐色懸浮液以醋酸乙酯萃取(兩次)，以硫酸鎂脫水乾燥，然後於減壓下蒸發，而得3,8-二溴基-6-羥基喹啉(M⁺-H 300，2x Br)，為深紅色固體，使用於下一階段無需進一步純化，¹H NMR (d6 DMSO) δ ：7.14 (1H, d)；7.60 (1H, d)；8.52 (1H, d)；8.71 (1H, d)。

以類似步驟3之程序，使6-胺基-3-溴基喹啉轉化成3-溴基-6-羥基喹啉，褐色固體，¹H NMR (d6 DMSO) δ ：7.19 (1H, d)；7.40 (1H, dd)；7.92 (1H, d)；8.66 (1H, s)；8.79 (1H, s)。

階段2：2-(3-溴基-6-喹啉基氧基)-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺之製備

於3-溴基-6-羥基喹啉(0.179克)與無水碳酸鉀(0.121克)在無水N,N-二甲基甲醯胺(2毫升)中之經攪拌混合物內，在80°C下，添加2-溴-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺(0.197克)，並將反應物於此溫度下保持15小時。使所製成之褐色懸浮液冷卻至環境溫度，倒入水中，並以乙醚萃取。將萃液以水洗滌，以硫酸鎂脫水乾燥，然後於減壓下蒸發，獲得褐色膠質。使

此膠質藉層析(矽膠；己烷 / 醋酸乙酯)分級分離，獲得2-(3-溴基-6-噻啉基氧基)-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺(0.125克)，為無色固體，熔點109-112°C， $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.08 (3H, t); 1.58 (3H, s); 1.59 (3H, s); 1.77 (3H, s); 1.99-2.06 (2H, m); 4.54 (1H, t); 6.37 (1H, s); 7.02 (1H, m); 7.42 (1H, dd); 8.02 (1H, d); 8.19 (1H, m); 8.78 (1H, m).

以類似程序，使3,8-二溴基-6-羥基噻啉與2-溴-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺反應，獲得2-(3,8-二溴基-6-噻啉基氧基)-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺，為無色膠質， $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.07 (3H, t); 1.59 (3H, s); 1.60 (3H, s); 1.78 (3H, s); 1.99-2.06 (2H, m); 4.52 (1H, t); 6.30 (1H, s); 7.00 (1H, m); 7.82 (1H, d); 8.21 (1H, d); 8.88 (1H, m).

實例 11

此實例係說明2-(3-氯基-6-噻啉基氧基)-N-(4-甲基-戊-2-炔-4-基)丁醯胺(表58之化合物編號2)之製備

階段1：3-氯基-6-羥基噻啉之製備

將3-溴基-6-羥基噻啉(2.75克)與氯化亞銅(9克)在無水N-甲基四氫吡咯-2-酮(25毫升)中攪拌，並於150°C及氮大氣下加熱2小時。使深紅色懸浮液冷卻至環境溫度，倒入水中，然後以足量氨水處理，以溶解固體物質。以鹽酸(2M)將藍色溶液帶至pH值5-6，接著添加醋酸乙酯。過濾混合物，並將不溶性固體以醋酸乙酯洗滌。分離濾液之有機成份，並將水相進一步以醋酸乙酯萃取。將醋酸乙酯離份合併，以鹽水洗滌，以硫酸鎂脫水乾燥，接著於減壓下蒸發，而得固體。使固體藉層析(矽膠；己烷 / 醋酸乙酯2：1體積比)分級分離

，獲得 3-氯基 -6-羥基 喹啉，為淡黃色固體，0.95 克。(M⁺ 179，1x Cl)。¹H NMR (CDCl₃) δ：7.06 (1H, d)；7.35 (1H, dd)；7.91 (1H, d)；7.96 (1H, d)；8.59 (1H, d)；9.55 (1H, s).

階段 2

於 3-氯基 -6-羥基 喹啉 (0.130 克) 與無水碳酸鉀 (0.110 克) 在無水 N,N-二甲基甲醯胺 (3 毫升) 中之經攪拌混合物內，在 80°C 下，添加 2-溴 -N-(4-甲基戊 -2-炔 -4-基) 丁醯胺 (0.197 克)，並將反應物於此溫度下保持 6 小時。使所製成之褐色懸浮液冷卻至環境溫度，倒入水中，並以乙醚萃取。將萃液以水洗滌，以硫酸鎂脫水乾燥，然後於減壓下蒸發，而得褐色膠質。使此膠質藉層析 (矽膠；己烷 / 醋酸乙酯 4：1 體積比) 分級分離，獲得 2-(3-氯基 -6-喹啉基氧基) -N-(4-甲基戊 -2-炔 -4-基) 丁醯胺 (0.167 克)，為無色固體，熔點 105-107°C，¹H NMR (CDCl₃) δ：1.08 (3H, t)；1.58 (3H, s)；1.59 (3H, s)；1.77 (3H, s)；1.99-2.08 (2H, m)；4.55 (1H, t)；6.37 (1H, s)；7.02 (1H, d)；7.41 (1H, dd)；8.01 (1H, d)；8.02 (1H, d)；8.70 (1H, m)；8.78 (1H, m).

實例 12

此實例係說明 2-(6-喹啉基氧基) -N-(1-甲氧基 -4-甲基戊 -2-炔 -4-基) 3-甲氧基丙醯胺 (表 11 之化合物編號 12) 與 2-(3-溴基 -6-喹啉基氧基) -N-(1-甲氧基 -4-甲基戊 -2-炔 -4-基) 3-甲氧基 -丙醯胺 (表 87 之化合物編號 12) 之製備

階段 1：2-溴 -N-(1-甲氧基 -4-甲基戊 -2-炔 -4-基) 3-甲氧基 -丙醯胺之製備

使 2-溴基 -3-甲氧基丙酸 (0.51 克) 溶於含有無水 N,N-二甲基甲

醯胺 (0.05 毫升) 之無水二氯甲烷 (10 毫升) 中，並攪拌，及添加氯化草醯 (0.36 克)。將混合物於環境溫度下攪拌 2 小時，然後在減壓下蒸發，而得氯化 2-溴基-3-甲氧基丙醯 ($C=O$, ν 1780 cm^{-1})。使氯化醯溶於無水二氯甲烷 (5 毫升) 中，並在 0 °C 下，添加至無水二氯甲烷 (10 毫升) 中之 4-胺基-1-甲氧基-4-甲基戊-2-炔鹽酸鹽 (0.46 克) 內，及攪拌。逐滴添加三乙胺 (0.78 毫升)，同時將反應溫度保持在 4-9 °C 之間。將已形成之懸浮液於環境溫度下攪拌 2 小時，在環境溫度下儲存 18 小時，以另外之二氯甲烷稀釋，並以碳酸氫鈉水溶液洗滌，接著以水洗滌 (兩次)。分離有機相，以硫酸鎂脫水乾燥，及在減壓下蒸發，獲得膠質。使此膠質藉層析 (矽膠：己烷 / 醋酸乙酯) 分級分離，獲得所需要之產物 (0.36 克)，為無色油， $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.66 (6H, s) ; 3.38 (3H, s) ; 3.44 (3H, s) ; 3.82-3.90 (2H, q) ; 4.12 (2H, s) ; 4.30-4.32 (1H, t) ; 6.62 (1H, s).

階段 2

以類似實例 6 階段 2 之程序，使 6-羥基喹啉與 2-溴-N-(1-甲氧基-4-甲基戊-2-炔-4-基)-3-甲氧基丙醯胺反應，獲得 2-(6-喹啉基氧基)-N-(1-甲氧基-4-甲基戊-2-炔-4-基)-3-甲氧基丙醯胺，為無色油。 $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.60 (3H, s) ; 1.62 (3H, s) ; 3.34 (3H, s) ; 3.44 (3H, s) ; 3.90-3.94 (2H, m) ; 4.06 (2H, s) ; 4.76-4.80 (1H, m) ; 6.60 (1H, s) ; 7.14-7.16 (1H, m) ; 7.36-7.40 (1H, m) ; 7.46-7.50 (1H, m) ; 8.04-8.08 (2H, d) ; 8.82-8.84 (1H, m).

階段 3

以類似實例 6 階段 2 之程序，使 3-溴基-6-羥基喹啉與 2-溴-N-(1-

甲氧基-4-甲基戊-2-炔-4-基)-3-甲氧基丙醯胺反應，而得2-(3-溴基-6-喹啉基氧基)-N-(1-甲氧基-4-甲基戊-2-炔-4-基)-3-甲氧基丙醯胺，為膠質。¹H NMR (CDCl₃) δ : 1.58 (3H, s); 1.59 (3H, s); 1.77 (3H, s); 3.44 (3H, s); 3.87-3.95 (2H, m); 4.73 (1H, m); 6.52 (1H, s); 7.08 (1H, m); 7.48 (1H, dd); 8.02 (1H, d); 8.21 (1H, m); 8.79 (1H, m).

實例 13

此實例係說明2-(6-喹啉基氧基)-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺1-氧化物(表134之化合物編號2)之製備

使2-(6-喹啉基氧基)-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺(1.0克)在二氯甲烷(25毫升)中冷卻至0°C，並攪拌，及分次添加3-氯過苯甲酸(1.21克，50%)，然後於0°C下再攪拌15分鐘，接著在環境溫度下1.5小時。將混合物以碳酸氫鈉水溶液(三次)，水(兩次)洗滌，以硫酸鎂脫水乾燥，接著於減壓下蒸發，獲得膠質，將其以乙醚研製，獲得所需要之產物，為淡褐色固體，0.75克，熔點140-143°C，¹H NMR (CDCl₃) δ : 1.06-1.10 (3H, t); 1.56 (3H, s); 1.58 (3H, s); 1.76 (3H, s); 2.00-2.08 (2H, m); 4.56 (1H, t); 6.32 (1H, s); 7.14 (1H, m); 7.28-7.30 (1H, d); 7.44-7.46 (1H, d); 7.62-7.64 (1H, d); 8.42-8.44 (1H, d); 8.70-8.72 (1H, d).

實例 14

此實例係說明2-(3-氰基-6-喹啉基氧基)-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺(表96之化合物編號2)之製備

階段1：3-氰基-6-羥基喹啉之製備[參考 *Liebigs Ann Chem* (1966), 98-106]

將3-溴基-6-羥基喹啉(1.12克)在無水N-甲基四氫吡咯-2-酮(10

毫升)中，以氰化亞銅(0.55克)處理，並於150°C及氮大氣下攪拌7小時，然後在環境溫度下儲存18小時。將混合物以氰化鈉(1.5克)在水(5毫升)中處理，並於75°C下加熱15分鐘。添加10%氯化銨水溶液(25毫升)，並使混合物冷卻至環境溫度。將反應混合物以醋酸乙酯萃取，並分離有機相，以水洗滌，以硫酸鎂脫水乾燥，及在減壓下蒸發，獲得黃褐色固體。使固體藉層析分級分離，獲得所需要之產物，為黃色固體。

階段2

以類似實例6階段2之程序，使3-氰基-6-羥基喹啉與2-溴-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺反應，獲得2-(3-氰基-6-喹啉基氧基)-N-(4-甲基戊-2-炔-4-基)丁醯胺，為淡黃色固體，熔點116-118°C，¹H NMR (CDCl₃) δ: 1.08 (3H, t); 1.61 (3H, s); 1.63 (3H, s); 1.80 (3H, s); 2.07-2.13 (2H, m); 4.72 (1H, t); 6.46 (1H, s); 7.50 (1H, m); 7.57 (1H, dd); 7.71 (1H, d); 8.17 (1H, d); 8.92 (1H, d).

實例15

此實例係說明2-(3-溴基-6-喹啉基氧基)-N-(1-氰基-6-甲基庚-4-炔-6-基)丁醯胺(表77之化合物編號90)與2-(3-溴基-6-喹啉基氧基)-N-(1-氯基-6-甲基庚-4-炔-6-基)丁醯胺(表77之化合物編號91)之製備

階段1: 2-溴-N-(1-氯基-6-甲基庚-4-炔-6-基)丁醯胺之製備

步驟1: 6-(1-氯基-6-甲基庚-4-炔-6-基)-2,2,5,5-四甲基-1-氮-2,5-二

矽環戊烷之製備

於氮大氣及-70°C下，在0.5小時內，將正-丁基鋰(97.6毫升

， 2.5 M，在己烷中)逐滴添加至 1-(1,1-二甲基-2-丙炔基)-2,2,5,5-四甲基-1-氮-2,5-二矽環戊烷(55.1 克)在無水四氫呋喃(450 毫升)中之經攪拌溶液內。將混合物於 -70°C 下攪拌 1.5 小時，使其溫熱至 -15°C ，然後於 20 分鐘內，逐滴添加 1-氯基-3-碘化丙烷(55.0 克)在無水四氫呋喃(50 毫升)中之溶液，同時使反應溫度慢慢溫熱至 0°C 。於添加完成時，將反應混合物在環境溫度下攪拌 4.25 小時，接著儲存 18 小時。將混合物以水稀釋，並以醋酸乙酯萃取(兩次)。將萃液合併，以水洗滌(三次)，以硫酸鎂脫水乾燥，然後於減壓下蒸發，而得所需要之產物，為橘色液體，78.5 克， $^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 0.00 (12H, s); 0.46 (4H, s); 1.30 (6H, s); 1.76 (2H, m); 2.18 (2H, t); 2.46 (2H, t).

步驟 2：1-氯基-6-甲基庚-4-炔-6-基胺鹽酸鹽之製備

將得自步驟 1 之產物(78.5 克)於 -5°C 下攪拌，並慢慢添加稀鹽酸水溶液(785 毫升，2M)，同時在添加期間，將反應溫度保持低於 30°C 。添加完成時，將混合物於環境溫度下再攪拌 1 小時，以乙醚洗滌(兩次)，在減壓下蒸發，並藉由與甲苯之共沸蒸餾作用移除殘留水。使所獲得之固體溶於二氯甲烷中，以硫酸鎂脫水乾燥，及在減壓下蒸發，獲得所需要之產物，為乳黃色固體，36.5 克， $^1\text{H NMR}(\text{CDCl}_3)$ δ : 1.74 (6H, s); 1.97 (2H, m); 2.39 (2H, m); 3.68 (2H, t); 8.80 (3H, 寬廣 s).

步驟 3：2-溴-N-(1-氯基-6-甲基庚-4-炔-6-基)丁醯胺之製備

使得自步驟 2 之產物(12.2 克)懸浮於無水二氯甲烷(300 毫升)中，冷卻至 5°C ，並攪拌，及添加無水三乙胺(18.1 毫升)。將混合物攪拌 0.25 小時，並於 $10-18^{\circ}\text{C}$ 下，在 0.5 小時內，逐滴添

加二氯甲烷(25毫升)中之溴化2-溴基丁鹽(14.3克)。將混合物再攪拌0.5小時，然後使其溫熱至環境溫度，歷經2小時，並儲存18小時。添加水，並分離有機相，以水洗滌(三次)，以硫酸鎂脫水乾燥，接著於減壓下蒸發，獲得所需要之產物，為暗黃色油，17.4克， $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.04 (3H, t); 1.62 (6H, s); 1.96 (2H, m); 2.10 (2H, m); 2.38 (2H, m); 3.66 (2H, t); 4.12 (1H, t); 6.44 (1H, s).

階段2

以類似實例6階段2之程序，使3-溴基-6-羥基喹啉與2-溴-N-(1-氯基-6-甲基庚-4-炔-6-基)丁鹽胺反應，獲得2-(3-溴基-6-喹啉基氧基)-N-(1-氯基-6-甲基庚-4-炔-6-基)丁鹽胺，為無色油。 $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.04-1.10 (3H, t); 1.60 (6H, s); 1.86-1.94 (2H, m); 2.00-2.06 (2H, m); 2.32-2.36 (2H, t); 3.60-3.64 (2H, t); 4.56 (1H, t); 6.34 (1H, s); 7.02 (1H, m); 7.42-7.46 (1H, dd); 8.03 (1H, d); 8.22 (1H, s); 8.78 (1H, s).

階段3

使階段2之產物(0.19克)溶於含有氰化鉀(0.056克)之無水N,N-二甲基甲鹽胺(4毫升)中，並攪拌，及加熱至100°C，歷經6小時，然後冷卻至環境溫度，並儲存2天。將混合物以水稀釋，並以醋酸乙酯萃取(三次)。將萃液合併，以水洗滌(兩次)，以硫酸鎂脫水乾燥，及在減壓下蒸發，而得黃色膠質。使此膠質藉層析(矽膠；己烷/醋酸乙酯，1:1體積比)分級分離，獲得2-(3-溴基-6-喹啉基氧基)-N-(1-氯基-6-甲基庚-4-炔-6-基)丁鹽胺，為黃色膠質，0.080克， $^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ : 1.04-1.10 (3H, t); 1.56 (6H, s); 1.78-1.84 (2H, m); 2.00-2.08 (2H, m)

; 2.32-2.36 (2H, t); 2.48-2.52 (2H, t); 4.58 (1H, t); 6.36 (1H, s); 7.02 (1H, d)
; 7.40-7.44 (1H, dd); 8.02 (1H, d); 8.22 (1H, s); 8.80 (1H, s).

實例 16

此實例係說明式(1)化合物之殺真菌性質。

此等化合物係在葉片圓盤檢測中，以下文所述之方法測試。使待測化合物溶於DMSO中，並稀釋至水中達200 ppm。在對終極腐霉測試之情況中，係使其溶於DMSO中，並稀釋至水中達20 ppm。

禾白粉菌大麥曲物種(大麥白粉病)：將大麥葉部片段放置在24-井板中之瓊脂上，並以待測化合物之溶液噴洒。使其完全乾燥12與24小時之間後，以真菌之孢子懸浮液接種葉片圓盤。於適當培養後，在接種後四天評估化合物之活性，作為預防殺真菌活性。

禾白粉菌小麥物種(小麥白粉病)：將小麥葉部片段放置在24-井板中之瓊脂上，並以待測化合物之溶液噴洒。使其完全乾燥12與24小時之間後，以真菌之孢子懸浮液接種葉片圓盤。於適當培養後，在接種後四天評估化合物之活性，作為預防殺真菌活性。

隱匿柄銹菌小麥物種(小麥褐銹病)：將小麥葉部片段放置在24-井板中之瓊脂上，並以待測化合物之溶液噴洒。使其完全乾燥12與24小時之間後，以真菌之孢子懸浮液接種葉片圓盤。於適當培養後，在接種後九天評估化合物之活性，作為預防殺真菌活性。

穎枯殼針孢(小麥穎片褐斑病)：將小麥葉部片段放置在24-

井板中之瓊脂上，並以待測化合物之溶液噴洒。使其完全乾燥12與24小時之間後，以真菌之孢子懸浮液接種葉片圓盤。於適當培養後，在接種後四天評估化合物之活性，作為預防殺真菌活性。

圓核腔菌(大麥網褐斑病)：將大麥葉部片段放置在24-井板中之瓊脂上，並以待測化合物之溶液噴洒。使其完全乾燥12與24小時之間後，以真菌之孢子懸浮液接種葉片圓盤。於適當培養後，在接種後四天評估化合物之活性，作為預防殺真菌活性。

稻梨孢(稻瘟病)：將稻米葉部片段放置在24-井板中之瓊脂上，並以待測化合物之溶液噴洒。使其完全乾燥12與24小時之間後，以真菌之孢子懸浮液接種葉片圓盤。於適當培養後，在接種後四天評估化合物之活性，作為預防殺真菌活性。

灰葡萄孢(灰霉病)：將豆葉片圓盤放置在24-井板中之瓊脂上，並以待測化合物之溶液噴洒。使其完全乾燥12與24小時之間後，以真菌之孢子懸浮液接種葉片圓盤。於適當培養後，在接種後四天評估化合物之活性，作為預防殺真菌活性。

致病疫霉(馬鈴薯之晚疫病於番茄上)：將番茄葉片圓盤放置在24-井板中之水瓊脂上，並以待測化合物之溶液噴洒。使其完全乾燥12與24小時之間後，以真菌之孢子懸浮液接種葉片圓盤。於適當培養後，在接種後四天評估化合物之活性，作為預防殺真菌活性。

葡萄生單軸霉(葡萄樹之絨毛白粉病)：將葡萄樹葉片圓盤放置在24-井板中之瓊脂上，並噴洒待測化合物之溶液。使其完全乾燥12與24小時之間後，以真菌之孢子懸浮液接種葉片圓盤。於適當培養後，在接種後七天評估化合物之活性，作為預防殺真菌活性。

終極腐霉(立枯病)：將製自新鮮液體培養物之真菌網狀菌絲體片段，混合至馬鈴薯右旋糖培養基中。將待測化合物在二甲亞砜中之溶液以水稀釋至20 ppm，然後置於96-井微滴定板中，並添加含有真菌孢子之營養培養基。使試驗板於24℃下培養，並在48小時後，以光度計方式測定生長之抑制。

下列化合物[化合物編號(表)]在200 ppm下獲得下列真菌感染之大於60%防治：

致病疫霉：2(1), 10(1), 12(1), 50(1), 2(20), 2(58), 2(77), 90(77), 91(77).

葡萄生單軸霉：2(1), 2(49), 2(58), 2(77), 90(77), 91(77), 2(96), 2(115).

禾白粉菌大麥曲物種：10(1), 2(17).

禾白粉菌小麥物種：10(1), 50(1), 2(77), 91(77), 2(115).

灰葡萄孢：2(77), 2(115).

隱匿柄銹菌小麥物種：90(77).

穎枯殼針孢：10(1).

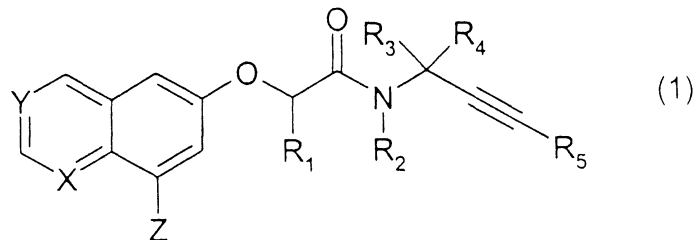
圓核腔菌：2(20).

下列化合物在20 ppm下獲得下列真菌感染之大於60%防治：

終極腐霉：2(1), 10(1), 12(1), 50(1), 2(11), 12(11), 2(17), 2(20), 2(39), 2(49), 2(77), 90(77), 91(77), 2(115), 2(134).

伍、中文發明摘要：

通式(1)殺真菌化合物：



其中X與Y之一為N或N-氧化物，而另一個為CR，或X與Y兩者均為N；

Z為H，鹵基，C₁₋₆烷基，視情況被鹵基或C₁₋₄烷氧基取代，C₃₋₆環烷基，視情況被鹵基或C₁₋₄烷氧基取代，C₂₋₄烯基，視情況被鹵基取代，C₂₋₄炔基，視情況被鹵基取代，C₁₋₆烷氧基，視情況被鹵基或C₁₋₄烷氧基取代，C₂₋₄烯氧基，視情況被鹵基取代，C₂₋₄炔氧基，視情況被鹵基取代，氰基、硝基、C₁₋₄烷氧羰基、-OSO₂R'、S(O)_nR'、-COR''、-CONR''R'''、-CR''=NOR'、NR''R'''、NR''COR'、NR''CO₂R'，其中n為0, 1或2，R'為C₁₋₆烷基，視情況被鹵素取代，且R''與R'''係獨立為H或C₁₋₆烷基，或在-CONR''R'''之情況中，可接合而形成5-或6-員環，含有單一氮原子、飽和碳原子及選用之單一氧原子；

R為H、鹵基、C₁₋₈烷基、C₃₋₆環烷基、C₂₋₈烯基、C₂₋₈炔基、C₁₋₈烷氧基、C₁₋₈烷硫基、硝基、胺基、單-或二-(C₁₋₆)烷胺基、單-或二-(C₂₋₆)烯基-胺基、單-或二-(C₂₋₆)炔基胺基、甲醯胺基、C₁₋₄烷基(甲醯基)胺基、C₁₋₄烷羰基胺基、C₁₋₄烷氧羰基胺基、C₁₋₄烷基(C₁₋₄烷基-羰基)胺基、氰基、甲醯基

、 C_{1-4} 烷羰基、 C_{1-4} 烷氧羰基、胺基-羰基、單-或二- (C_{1-4}) 烷基胺基羰基、羧基、 C_{1-4} 烷羰基氧基、芳基 (C_{1-4}) 烷羰基氧基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基或 C_{1-4} 烷基-磺醯基氧基；

R_1 為 C_{1-4} 烷基、 C_{2-4} 烯基或 C_{2-4} 炔基，其中烷基、烯基及炔基係視情況在其末端碳原子上被一、二或三個鹵原子，被氰基，被 C_{1-4} 烷羰基，被 C_{1-4} 烷氧羰基，或被羥基取代，或 R_1 為烷氧烷基、烷基硫基烷基、烷基亞磺醯基烷基或烷基磺醯基烷基，其中碳原子總數為 2 或 3，或

R_1 為直鏈 C_{1-4} 烷氧基；

R_2 為 H、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基甲基或苄氧基甲基，其中苄基部份基團之苯環係視情況被 C_{1-4} 烷氧基取代；

R_3 與 R_4 係獨立為 H、 C_{1-3} 烷基、 C_{2-3} 烯基或 C_{2-3} 炔基，其條件是，兩者不同時為 H，且當兩者為 H 以外者時，其合併之碳原子總數不超過 4，或

R_3 與 R_4 和彼等所連接之碳原子一起接合，以形成 3 或 4 員碳環，視情況含有一個 O、S 或 N 原子，且視情況被鹵基或 C_{1-4} 烷基取代；及

R_5 為 H、 C_{1-4} 烷基或 C_{3-6} 環烷基，其中烷基或環烷基係視情況被以下基團取代，鹵基、羥基、 C_{1-6} 烷氧基、氰基、 C_{1-4} 烷羰基-氧基、胺基羰基氧基、單-或二- (C_{1-4}) 烷基胺基羰基氧基、 $-S(O)_n(C_{1-6})$ -烷基，其中 n 為 0, 1 或 2，三唑基(例如 1,2,4-三唑-1-基)、三- (C_{1-4}) 烷基矽烷基氧基、視情況經取代之苯氧基、視情況經取代之噻吩基氧基、視情況經取代之苄氧基或

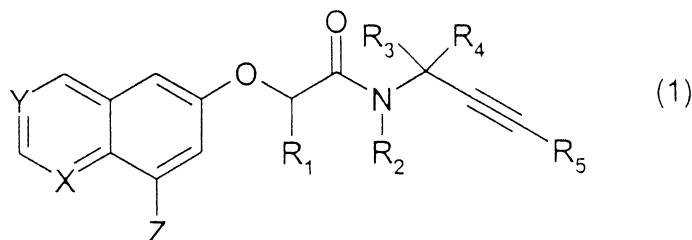
視情況經取代之噻吩基甲氧基，或

R_5 為視情況經取代之苯基、視情況經取代之噻吩基或視情況經取代之苄基，

其中 R_5 意義之視情況經取代之苯基與噻吩基環係視情況被一、二或三個取代基取代，選自鹵基、羥基、巰基、 C_{1-4} 烷基、 C_{2-4} 烯基、 C_{2-4} 炔基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{2-4} 烯氧基、 C_{2-4} 炔氧基、鹵基(C_{1-4})烷基、鹵基(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、鹵基(C_{1-4})烷硫基、羥基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯氧基、苄氧基、苯甲酰氧基、氰基、異氰基、氰硫基、異硫氰基、硝基、 $-NR^mR^n$ 、 $-NHCOR^m$ 、 $-NHCONR^mR^n$ 、 $-CONR^mR^n$ 、 $-SO_2R^m$ 、 $-OSO_2R^m$ 、 $-COR^m$ 、 $-CR^m=NR^n$ 或 $-N=CR^mR^n$ ，其中 R^m 與 R^n 係獨立為氫、 C_{1-4} 烷基、鹵基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基、鹵基(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯基或苄基，該苯基與苄基係視情況被鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代。

陸、英文發明摘要：

Fungicidal compounds of the general formula (1):



wherein one of X and Y is N or N-oxide and the other is CR or both of X and Y are N;

Z is H, halo, C₁₋₆ alkyl optionally substituted with halo or C₁₋₄ alkoxy, C₃₋₆ cycloalkyl optionally substituted with halo or C₁₋₄ alkoxy, C₂₋₄ alkenyl optionally substituted with halo, C₂₋₄ alkynyl optionally substituted with halo, C₁₋₆ alkoxy optionally substituted with halo or C₁₋₄ alkoxy, C₂₋₄ alkenyloxy optionally substituted with halo, C₂₋₄ alkynyloxy optionally substituted with halo, cyano, nitro, C₁₋₄ alkoxycarbonyl, -OSO₂R', S(O)_nR', -COR'', -CONR''R''', -CR''=NOR', NR''R''', NR''COR', NR''CO₂R' where n is 0, 1 or 2, R' is C₁₋₆ alkyl optionally substituted with halogen and R'' and R''' are independently H or C₁₋₆ alkyl or, in the case of -CONR''R''', may join to form a 5- or 6-membered ring containing a single nitrogen atom, saturated carbon atoms and optionally a single oxygen atom; R is H, halo, C₁₋₈ alkyl, C₃₋₆ cycloalkyl, C₂₋₈ alkenyl, C₂₋₈ alkynyl, C₁₋₈ alkoxy, C₁₋₈ alkylthio, nitro, amino, mono- or di-(C₁₋₆)alkylamino, mono- or di-(C₂₋₆)alkenylamino, mono- or di-(C₂₋₆)alkynylamino, formylamino, C₁₋₄ alkyl(formyl)amino, C₁₋₄ alkylcarbonylamino, C₁₋₄ alkoxycarbonylamino, C₁₋₄ alkyl(C₁₋₄ alkylcarbonyl)amino, cyano, formyl, C₁₋₄ alkylcarbonyl, C₁₋₄ alkoxycarbonyl, aminocarbonyl, mono- or di-(C₁₋₄)alkylaminocarbonyl, carboxy, C₁₋₄ alkylcarbonyloxy, aryl(C₁₋₄)alkylcarbonyloxy, C₁₋₄ alkylsulphinyl, C₁₋₄ alkylsulphonyl or C₁₋₄ alkylsulphonyloxy;

R₁ is C₁₋₄ alkyl, C₂₋₄ alkenyl or C₂₋₄ alkynyl in which the alkyl, alkenyl and alkynyl groups are optionally substituted on their terminal carbon atom with one, two or three halogen atoms, with a cyano group, with a C₁₋₄ alkylcarbonyl group, with a C₁₋₄ alkoxycarbonyl group or with a hydroxy group, or

R_1 is alkoxyalkyl, alkylthioalkyl, alkylsulphinylalkyl or alkylsulphonylalkyl in which the total number of carbon atoms is 2 or 3, or

R_1 is a straight-chain C_{1-4} alkoxy group;

R_2 is H, C_{1-4} alkyl, C_{1-4} alkoxymethyl or benzyloxymethyl in which the phenyl ring of the benzyl moiety is optionally substituted with C_{1-4} alkoxy;

R_3 and R_4 are independently H, C_{1-3} alkyl, C_{2-3} alkenyl or C_{2-3} alkynyl provided that both are not H and that when both are other than H their combined total of carbon atoms does not exceed 4, or

R_3 and R_4 join with the carbon atom to which they are attached to form a 3 or 4 membered carbocyclic ring optionally containing one O, S or N atom and optionally substituted with halo or C_{1-4} alkyl; and

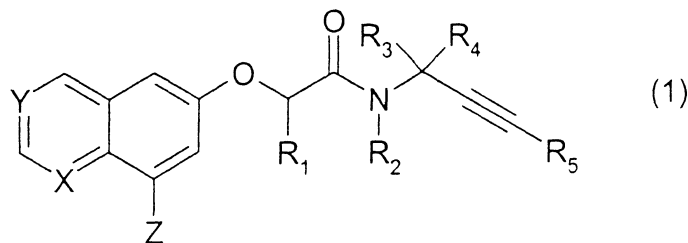
R_5 is H, C_{1-4} alkyl or C_{3-6} cycloalkyl in which the alkyl or cycloalkyl group is optionally substituted with halo, hydroxy, C_{1-6} alkoxy, cyano, C_{1-4} alkylcarbonyloxy, aminocarbonyloxy, mono- or di(C_{1-4})alkylaminocarbonyloxy, $-S(O)_n(C_{1-6})$ -alkyl where n is 0, 1 or 2, triazolyl (e.g. 1,2,4-triazol-1-yl), tri(C_{1-4})alkylsilyloxy, optionally substituted phenoxy, optionally substituted thienyloxy, optionally substituted benzyloxy or optionally substituted thienylmethoxy, or

R_5 is optionally substituted phenyl, optionally substituted thienyl or optionally substituted benzyl,

in which the optionally substituted phenyl and thienyl rings of the R_5 values are optionally substituted with one, two or three substituents selected from halo, hydroxy, mercapto, C_{1-4} alkyl, C_{2-4} alkenyl, C_{2-4} alkynyl, C_{1-4} alkoxy, C_{2-4} alkenyloxy, C_{2-4} alkynyloxy, halo (C_{1-4})alkyl, halo(C_{1-4})alkoxy, C_{1-4} alkylthio, halo(C_{1-4})alkylthio, hydroxy(C_{1-4})alkyl, C_{1-4} alkoxy(C_{1-4})alkyl, C_{3-6} cycloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, phenoxy, benzyloxy, benzoyloxy, cyano, isocyano, thiocyanato, isothiocyanato, nitro, $-NR^mR^n$, $-NHCOR^m$, $-NHCONR^mR^n$, $-CONR^mR^n$, $-SO_2R^m$, $-OSO_2R^m$, $-COR^m$, $-CR^m=NR^n$ or $-N=CR^mR^n$, in which R^m and R^n are independently hydrogen, C_{1-4} alkyl, halo(C_{1-4})alkyl, C_{1-4} alkoxy, halo(C_{1-4})alkoxy, C_{1-4} alkylthio, C_{3-6} cycloalkyl, C_{3-6} cycloalkyl(C_{1-4})alkyl, phenyl or benzyl, the phenyl and benzyl groups being optionally substituted with halogen, C_{1-4} alkyl or C_{1-4} alkoxy.

拾、申請專利範圍：

1. 一種通式(1)化合物：



其中X與Y之一為N或N-氧化物，而另一個為CR，或X與Y兩者均為N；

Z為H，鹵基，C₁₋₆烷基，視情況被鹵基或C₁₋₄烷氧基取代，C₃₋₆環烷基，視情況被鹵基或C₁₋₄烷氧基取代，C₂₋₄烯基，視情況被鹵基取代，C₂₋₄炔基，視情況被鹵基取代，C₁₋₆烷氧基，視情況被鹵基或C₁₋₄烷氧基取代，C₂₋₄烯氧基，視情況被鹵基取代，C₂₋₄炔氧基，視情況被鹵基取代，氰基、硝基、C₁₋₄烷氧羰基、-OSO₂R'、S(O)_nR'、-COR''、-CONR''R'''、-CR''=NOR'、NR''R'''、NR''COR'、NR''CO₂R'，其中n為0,1或2，R'為C₁₋₆烷基，視情況被鹵素取代，且R''與R'''係獨立為H或C₁₋₆烷基，或在-CONR''R'''之情況中，可接合而形成5-或6-員環，含有單一氮原子、飽和碳原子及選用之單一氧原子；

R為H、鹵基、C₁₋₈烷基、C₃₋₆環烷基、C₂₋₈烯基、C₂₋₈炔基、C₁₋₈烷氧基、C₁₋₈烷硫基、硝基、胺基、單-或二-(C₁₋₆)烷胺基、單-或二-(C₂₋₆)烯基-胺基、單-或二-(C₂₋₆)炔基胺基、甲醯胺基、C₁₋₄烷基(甲醯基)胺基、C₁₋₄烷羰基胺基、C₁₋₄烷氧羰基胺基、C₁₋₄烷基(C₁₋₄烷基-羰基)胺基、氰

基、甲醯基、 C_{1-4} 烷羰基、 C_{1-4} 烷氧羰基、胺基-羰基、單-或二- (C_{1-4}) 烷胺基羰基、羧基、 C_{1-4} 烷羰基氧基、芳基 (C_{1-4}) 烷羰基氧基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基或 C_{1-4} 烷基-磺醯基氧基；

R_1 為 C_{1-4} 烷基、 C_{2-4} 烯基或 C_{2-4} 炔基，其中烷基、烯基及炔基係視情況在其末端碳原子上被一、二或三個鹵原子，被氰基、被 C_{1-4} 烷羰基、被 C_{1-4} 烷氧羰基或被羥基取代，或

R_1 為烷氧烷基、烷基硫基烷基、烷基亞磺醯基烷基或烷基磺醯基烷基，其中碳原子總數為2或3，或

R_1 為直鏈 C_{1-4} 烷氧基；

R_2 為H、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基甲基或苄氧基甲基，其中苄基部份基團之苯環係視情況被 C_{1-4} 烷氧基取代；

R_3 與 R_4 係獨立為H、 C_{1-3} 烷基、 C_{2-3} 烯基或 C_{2-3} 炔基，其條件是，兩者不同時為H，且當兩者為H以外者時，其合併之碳原子總數不超過4，或

R_3 與 R_4 和彼等所連接之碳原子一起接合，以形成3或4員碳環，視情況含有一個O、S或N原子，且視情況被鹵基或 C_{1-4} 烷基取代；及

R_5 為H、 C_{1-4} 烷基或 C_{3-6} 環烷基，其中烷基或環烷基係視情況被以下基團取代，鹵基、羥基、 C_{1-6} 烷氧基、氰基、 C_{1-4} 烷羰基-氧基、胺基羰基氧基、單-或二- (C_{1-4}) 烷胺基羰基氧基、 $-S(O)_n(C_{1-6})$ -烷基，其中n為0,1或2，三唑基(例如1,2,4-三唑-1-基)、三- (C_{1-4}) 烷基矽烷基氧基、視情況

經取代之苯氧基、視情況經取代之噻吩基氧基、視情況經取代之苄氧基或視情況經取代之噻吩基甲氧基，或
 R_5 為視情況經取代之苯基、視情況經取代之噻吩基或視情況經取代之苄基，

其中 R_5 意義之視情況經取代之苯基與噻吩基環係視情況被一、二或三個取代基取代，選自鹵基、羥基、巰基、 C_{1-4} 烷基、 C_{2-4} 烯基、 C_{2-4} 炔基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{2-4} 烯氧基、 C_{2-4} 炔氧基、鹵基(C_{1-4})烷基、鹵基(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、鹵基(C_{1-4})烷硫基、羥基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯氧基、苄氧基、苯甲醯氧基、氰基、異氰基、氰硫基、異硫氰基、硝基、 $-NR^m R^n$ 、 $-NHCOR^m$ 、 $-NHCONR^m R^n$ 、 $-CONR^m R^n$ 、 $-SO_2 R^m$ 、 $-OSO_2 R^m$ 、 $-COR^m$ 、 $-CR^m=NR^n$ 或 $-N=CR^m R^n$ ，其中 R^m 與 R^n 係獨立為氫、 C_{1-4} 烷基、鹵基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基、鹵基(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯基或苄基，該苯基與苄基係視情況被鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代。

2. 根據申請專利範圍第1項之化合物，其中 R_5 不為 H。
3. 根據申請專利範圍第1或2項之化合物，其中 R 為 H 或鹵基、氰基。
4. 根據申請專利範圍第1或2項之化合物，其中 R_1 為甲基、乙基、正-丙基、2,2,2-三氟甲基、氰基甲基、乙醯基甲基、甲氧羰基甲基、甲氧羰基乙基、羥甲基、羥乙基、甲氧基甲基、甲硫基甲基、乙氧基甲基、2-甲氧基乙基、2-

甲基-硫基乙基、甲氧基、乙氧基、正-丙氧基或正-丁氧基。

5. 根據申請專利範圍第1或2項之化合物，其中 R_1 為乙基、甲氧基、乙氧基或甲氧基甲基。
6. 根據申請專利範圍第1或2項之化合物，其中 R_2 為H。
7. 根據申請專利範圍第1或2項之化合物，其中 R_3 與 R_4 兩者均為甲基。
8. 根據申請專利範圍第1或2項之化合物，其中 R_5 為H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、第三-丁基二甲基-矽烷氧基甲基、3-氰基丙基、3-甲氧基丙基、3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基、3-甲硫基丙基、3-甲烷亞磺醯基丙基或3-甲烷磺醯基丙基。
9. 根據申請專利範圍第1項之化合物，其中X與Y之一為N，而另一個為CR，或X與Y兩者均為N；

Z為H；

R為H、鹵基、 C_{1-8} 烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{2-8} 烯基、 C_{2-8} 炔基、 C_{1-8} 烷氧基、 C_{1-8} 烷硫基、硝基、胺基、單-或二- (C_{1-6}) 烷胺基、單-或二- (C_{2-6}) -烯基胺基、單-或二- (C_{2-6}) 炔基胺基、甲醯胺基、 C_{1-4} 烷基(甲醯基)-胺基、 C_{1-4} 烷羰基胺基、 C_{1-4} 烷基(C_{1-4} 烷羰基)胺基、氰基、甲醯基、 C_{1-4} 烷羰基、 C_{1-4} 烷氧羰基、胺基羰基、單-或二- (C_{1-4}) 烷胺基羰基、羧基、 C_{1-4} 烷羰基氧基、芳基($C_{1-4})$ 烷基-羰基氧基、 C_{1-4} 烷基亞磺醯基、 C_{1-4} 烷基磺醯基或 C_{1-4} 烷基磺醯基氧基；

R_1 為 C_{1-4} 烷基、 C_{2-4} 烯基或 C_{2-4} 炔基，其中烷基、烯基及炔基係視情況在其末端碳原子上被一、二或三個鹵原子，被氰基、被 C_{1-4} 烷羰基、被 C_{1-4} 烷氧羰基或被羥基取代，或

R_1 為烷氧烷基、烷基硫基烷基、烷基亞磺基烷基或烷基磺基烷基，其中碳原子總數為 2 或 3，或 R_1 為直鏈 C_{1-4} 烷氧基；

R_2 為 H、 C_{1-4} 烷基、 C_{1-4} 烷氧基甲基或苄氧基甲基，其中苄基部份基團之苯環係視情況被 C_{1-4} 烷氧基取代；

R_3 與 R_4 係獨立為 H、 C_{1-3} 烷基、 C_{2-3} 烯基或 C_{2-3} 炔基，其條件是，兩者不同時為 H，且當兩者為 H 以外者時，其合併之碳原子總數不超過 4，或

R_3 與 R_4 和彼等所連接之碳原子一起接合，以形成 3 或 4 員碳環，視情況含有一個 O、S 或 N 原子，且視情況被鹵基或 C_{1-4} 烷基取代；及

R_5 為 H、 C_{1-4} 烷基或 C_{3-6} 環烷基，其中烷基或環烷基係視情況被以下基團取代，鹵基、羥基、 C_{1-6} 烷氧基、 C_{1-6} 烷硫基、氰基、 C_{1-4} 烷羰基氧基、胺基羰基氧基或單-或二(C_{1-4}) 烷胺基羰基氧基、三(C_{1-4}) 烷基-矽烷基氧基、視情況經取代之苯氧基、視情況經取代之噻吩基氧基、視情況經取代之苄氧基或視情況經取代之噻吩基甲氧基，或

R_5 為視情況經取代之苯基、視情況經取代之噻吩基或視情況經取代之苄基，

其中 R_5 意義之視情況經取代之苯基與噻吩基環係視情況

被一、二或三個取代基取代，選自鹵基、羥基、巰基、 C_{1-4} 烷基、 C_{2-4} 烯基、 C_{2-4} 炔基、 C_{1-4} 烷氧基、 C_{2-4} 烯氧基、 C_{2-4} 炔氧基、鹵基(C_{1-4})烷基、鹵基(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、鹵基(C_{1-4})烷硫基、羥基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基(C_{1-4})烷基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯氧基、苄氧基、苯甲鹽氧基、氰基、異氰基、硫基氰氧基、異硫氰基、硝基、 $-NR^mR^n$ 、 $-NHCOR^m$ 、 $-NHCONR^mR^n$ 、 $-CONR^mR^n$ 、 $-SO_2R^m$ 、 $-OSO_2R^m$ 、 $-COR^m$ 、 $-CR^m=NR^n$ 或 $-N=CR^mR^n$ ，其中 R^m 與 R^n 係獨立為氫、 C_{1-4} 烷基、鹵基(C_{1-4})烷基、 C_{1-4} 烷氧基、鹵基(C_{1-4})烷氧基、 C_{1-4} 烷硫基、 C_{3-6} 環烷基、 C_{3-6} 環烷基(C_{1-4})烷基、苯基或苄基，該苯基與苄基係視情況被鹵素、 C_{1-4} 烷基或 C_{1-4} 烷氧基取代。

10. 根據申請專利範圍第1項之化合物，其中X與Y之一為N，而另一個為CR，或X與Y兩者均為N；Z為H；R為H、鹵基或氰基； R_1 為甲基、乙基、正-丙基、2,2,2-三氟甲基、氰基甲基、乙鹽基甲基、甲氧羰基-甲基、甲氧羰基乙基、羥甲基、羥乙基、甲氧基甲基、甲硫基甲基、乙氧基甲基、2-甲氧基乙基、2-甲硫基乙基、甲氧基、乙氧基、正-丙氧基或正-丁氧基； R_2 為H； R_3 與 R_4 均為甲基；及 R_5 為H、甲基、羥甲基、甲氧基甲基、1-甲氧基乙基、第三-丁基二甲基-矽烷氧基甲基、3-氰基丙基、3-甲氧基丙基、3-(1,2,4-三唑-1-基)丙基、3-甲硫基丙基、3-甲烷亞磺鹽基丙基或3-甲烷磺鹽基丙基。

11. 一種製備根據申請專利範圍第1項之化合物之方法，其係

如本文中所述。

12. 一種殺真菌組合物，其包含殺真菌上有效量之根據申請專利範圍第1或9項之式(1)化合物，及供其使用之適當載劑或稀釋劑。
13. 一種撲滅或防治植物病原真菌之方法，其包括將殺真菌上有效量之根據申請專利範圍第1項之式(1)化合物或根據申請專利範圍第12項之組合物施用至植物，至植物之種子，至植物或種子之地點，或至土壤或任何其他植物生長媒質。

柒、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第 () 圖。

(二)本代表圖之元件代表符號簡單說明：

捌、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：