



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公告本

(11)證書號數：TW I823960 B

(45)公告日：中華民國 112 (2023) 年 12 月 01 日

(21)申請案號：108123488

(22)申請日：中華民國 108 (2019) 年 07 月 03 日

(51)Int. Cl. : C07D333/38 (2006.01)

A01N43/10 (2006.01)

A01P1/00 (2006.01)

(30)優先權：2018/07/05

歐洲專利局

18181930.1

(71)申請人：德商拜耳廠股份有限公司 (德國) BAYER AKTIENGESELLSCHAFT (DE)
德國

(72)發明人：伯尼爾 大衛 BERNIER, DAVID (FR)；布律內 史蒂芬 BRUNET, STEPHANE (FR)；杜芙 傑瑞米 DUFOUR, JEREMY (FR)；諾布洛克 湯瑪士 KNOBLOCH, THOMAS (FR)；尼可拉斯 萊諾 NICOLAS, LIONEL (FR)；土屋知已 TSUCHIYA, TOMOKI (JP)

(74)代理人：陳長文

(56)參考文獻：

TW 202005535A

WO 2004/024692A1

審查人員：藍昇軒

申請專利範圍項數：14 項 圖式數：0 共 127 頁

(54)名稱

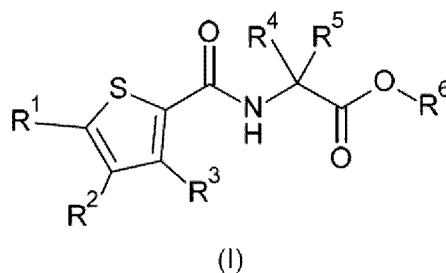
經取代之噻吩甲醯胺及類似物

(57)摘要

本發明係關於經取代之噻吩甲醯胺及其類似物，其可用於保護植物免受細菌性病害，尤其免受由屬於菌屬黃單胞菌(Xanthomonas)之細菌所引起之細菌性病害。

The present disclosure relates to substituted thiophene carboxamides and analogues thereof that may be used for protecting plants from bacterial diseases, in particular from bacterial diseases caused by bacteria belonging to the genus Xanthomonas.

特徵化學式：





I823960

【發明摘要】

【中文發明名稱】

經取代之噻吩甲醯胺及類似物

【英文發明名稱】

SUBSTITUTED THIOPHENECARBOXAMIDES AND ANALOGUES

【中文】

本發明係關於經取代之噻吩甲醯胺及其類似物，其可用於保護植物免受細菌性病害，尤其免受由屬於菌屬黃單胞菌(*Xanthomonas*)之細菌所引起之細菌性病害。

【英文】

The present disclosure relates to substituted thiophene carboxamides and analogues thereof that may be used for protecting plants from bacterial diseases, in particular from bacterial diseases caused by bacteria belonging to the genus *Xanthomonas*.

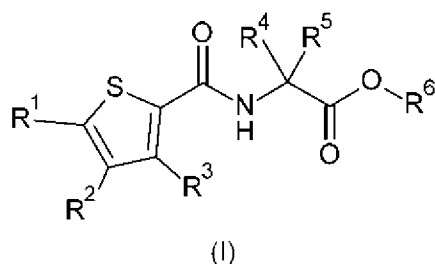
【指定代表圖】

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】

經取代之噻吩甲醯胺及類似物

【英文發明名稱】

SUBSTITUTED THIOPHENECARBOXAMIDES AND ANALOGUES

【技術領域】

【0001】 本發明係關於經取代之噻吩甲醯胺及其類似物，其可用於保護植物免受尤其由屬於菌屬黃單胞菌(*Xanthomonas*)之細菌所引起之細菌性病害。

【先前技術】

【0002】 植物病原細菌可在全世界引起嚴重的經濟損壞病害。屬於菌屬黃單胞菌之細菌在植物病原細菌中被視為最具破壞性的。其為具有農藝意義之不同宿主植物上的各種病害之致病原因。此等病害之實例包括：影響辣椒及番茄之細菌性斑病(由野油菜黃單胞菌胞病致病變種(*Xanthomonas campestris* pv. *vesicatoria*)所引起)；影響所有經培育芸苔屬(例如，孢子甘藍(Brussels sprouts)、甘藍菜、花椰菜及椰菜)之十字花科植物之黑腐病(由野油菜黃單胞菌野油菜致病變種(*Xanthomonas campestris* pv. *campestris*)所引起)、影響柑橘物種(酸橙、橙、葡萄柚、柚)之柑橘潰瘍病(由地毯草黃單胞菌柑桔致病變種(*Xanthomonas axonopodis* pv. *citri*)所引起)、影響稻之細菌性葉枯病(由水稻黃單胞菌水稻致病變種(*Xanthomonas oryzae* pv. *oryzae*)所引起)、影響李屬物種(例如，杏、李、桃)之葉斑病(由樹生黃單胞菌桃李致病變種(*Xanthomonas arboricola* pv. *pruni*)所引起)、影響豆之常見細菌性枯萎病(由菜豆黃單胞

菌(*Xanthomonas phaseoli*)所引起)、影響木薯之木薯細菌性枯萎病(由地毯草黃單胞菌木薯致病變種(*Xanthomonas axonopodis* pv. *manihotis*)所引起)以及影響棉之角狀葉斑病/細菌性枯萎病(由野油菜黃單胞菌錦葵致病變種(*Xanthomonas campestris* pv. *malvacearum*)所引起)。

【0003】 細菌性植物病害可以不同方式控制，主要包括使用耐病性各種各樣的植物及使用殺菌劑(天然的或合成的)。醫學中的耐抗生素危機及一些耐抗生素植物病原體之出現已觸發抗生素之替代物之研發，以便保持其功效及加寬病害管理解決方案之範疇。因此，已研發出不直接作用於病原性細菌，亦即不具有直接的抗生素效果，但刺激植物自身之防禦系統的產品。此等產品稱為植物防禦活化劑。植物防禦活化劑之實例包括：活化酯-S-甲基(acibenzolar-S-methyl) (如Bion®及Actigard®所市售)、2,6-二氯異菸鹼酸、 β -胺基丁酸、撲殺熱(probenazole) (Oryzmate®)、水楊酸、核黃素、調環酸鈣(prohexadione-calcium)、膦酸鉀、超敏蛋白(harpin protein) (Messenger®)及茉莉酸甲酯。

【0004】 儘管已展示許多不同有機及無機化合物活化植物之所誘導耐藥性，但目前僅商售很少的產品。

【0005】 因此，仍然需要提供新化學品及方法，允許以低劑量有效地控制細菌性病害，尤其由屬於菌屬黃單胞菌之細菌所引起之病害，同時不與細菌直接地相互作用以便防止耐藥性產生。由於化學品不與細菌直接地相互作用，其不太可能對此等化學品產生耐藥性。

【0006】 本發明者已證明屬於經取代噻吩甲醯胺衍生物之類別的新化學品提供上文問題之解決方案。

【0007】 已知一些經取代噻吩甲醯胺衍生物適用於抗擊植物病害。

舉例而言，US 5,534,541或EP0450355揭示鹵代噻吩甲酸衍生物，其適用於經由直接作用或系統性作用保護植物免受植物損害微生物(諸如真菌及細菌)的攻擊。然而，本發明者發現此等化合物在低劑量下不佳地有效抵抗野油菜黃單胞菌野油菜致病變種。

【0008】 鹵代噻吩甲酸衍生物之其他實例揭示於WO2004/024692中。此等衍生物據稱在控制真菌性方面病害有效。其將經由對非所需微生物之直接效果發揮其作用，但亦歸功於對植物的耐藥性誘導效果。WO2004/024692亦表明此等化合物可用於控制細菌性病害，但不提供此活性之任何證據。本發明者亦發現此等化合物在低劑量下不佳地有效抵抗野油菜黃單胞菌野油菜致病變種。

【發明內容】

【0009】 本發明係關於如本文及申請專利範圍中所揭示之式(I)化合物。

【0010】 本發明亦係關於一種如本文及申請專利範圍中所揭示之用於控制細菌性病害的方法。

【0011】 本發明係關於用於製備式(I)化合物之方法及如本文及申請專利範圍中所揭示之其中間物。

【實施方式】

【0012】

定義

如本文中所使用之術語「C₁-C₆-烷基」係指具有1、2、3、4、5或6個碳原子之飽和、分支鏈或直鏈烴鏈。C₁-C₆-烷基之實例包括(但不限於)甲基、乙基、丙基(正丙基)、1-甲基乙基(異丙基)、丁基(正丁基)、1-甲基

丙基(第二丁基)、2-甲基丙基(異丁基)、1,1-二甲基乙基(第三丁基)、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、己基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1,1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基及1-乙基-2-甲基丙基。特定言之，該烴鏈具有1、2、3或4個碳原子(「C₁-C₄-烷基」)，例如甲基、乙基、丙基、異丙基、丁基、第二丁基、異丁基或第三丁基。

【0013】 如本文中所使用之術語「烯基」應理解為較佳地意謂分支鏈及非分支鏈烯基，例如乙烯基、丙烯-1-基、丙烯-2-基、丁-1-烯-1-基、丁-1-烯-2-基、丁-2-烯-1-基、丁-2-烯-2-基、丁-1-烯-3-基、2-甲基-丙-2-烯-1-基或2-甲基-丙-1-烯-1-基。

【0014】 如本文中所使用之術語「炔基」應理解為較佳地意謂分支鏈及非分支鏈炔基，例如，乙炔基、丙-1-炔-1-基、丁-1-炔-1-基、丁-2-炔-1-基或丁-3-炔-1-基。

【0015】 如本文中所使用之術語「C₁-C₆-烷基氫硫基」係指式(C₁-C₆-烷基)-S-之飽和、直鏈或分支鏈基團，其中術語「C₁-C₆-烷基」如本文中所定義。C₁-C₆-烷基硫基之實例包括(但不限於)甲基氫硫基、乙基氫硫基、丙基氫硫基、異丙基氫硫基、丁基氫硫基、第二丁基氫硫基、異丁基氫硫基、第三丁基氫硫基、戊基氫硫基、異戊基氫硫基、己基氫硫基。

【0016】 如本文中所使用之術語「芳基」係指包含6至12個碳原子，較佳6至10個碳原子之芳族、烴、環系統。環系統可為單環或稠合多

環(例如，雙環或三環)芳族環系統。芳基之實例包括(但不限於)苯基、萸基(azulenyl)、萘基(naphthyl)、聯苯基及芴基(fluorenyl)。

【0017】如本文中所使用之術語「芳烷基」係指經如本文中所定義之芳基取代之 C_1-C_6 -烷基。芳烷基之實例包括苯甲基($-CH_2-C_6H_5$)。

【0018】如本文中所使用之術語「環烷基」係指具有3至8個碳原子之非芳族單環含碳環。飽和環烷基之實例包括(但不限於)環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基、環辛基、環壬基及環癸基。

【0019】如本文中所使用之術語「雜環基」係指含有獨立地選自氧、氮及硫之群的一個至四個雜原子的四員、五員或六員飽和或部分不飽和雜環。若環含有超過一個氧原子，則其不直接相鄰。

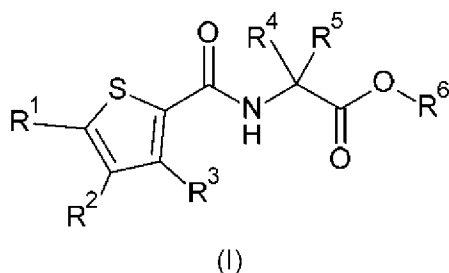
【0020】如本文中所使用之術語「芳基」係指包含6至15個碳原子或6至12個碳原子，較佳6至10個碳原子之芳族、烴、環系統。環系統可為單環或稠合多環(例如，雙環或三環)芳族環系統。芳基之實例包括(但不限於)苯基、萸基、萘基及芴基。此外應理解，當該芳基經一或多個取代基取代時，該(該等)取代基可處於該(該等)芳環上之任何位置處。特定言之，在芳基為苯基之情況下，該(該等)取代基可佔據一個或兩個鄰位、一個或兩個間位或對位，或此等位置之任何組合。此定義亦適用於作為複合取代基(例如，芳氧基)之部分的芳基。

【0021】

詳細描述

已發現如下文所展示之式(I)化合物在低劑量(亦即，低至31 ppm之劑量)下有效地控制由菌屬黃單胞菌之細菌所引起的病害，同時不展現直接殺菌作用。

【0022】 因此，本發明係關於式(I)化合物：



其中

R^1 及 R^2 相同且為氯原子或溴原子；

R^3 為甲基；

R^4 選自以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、芳烷基、經經基取代之芳烷基、經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 為氫原子；或

R^4 及 R^5 與其所連接之碳原子一起形成環丙基；

R^6 選自由以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -鹵烷基、 C_1 - C_6 -氰基烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_8 -環烷基、芳基、芳烷基、4員雜環基、5員雜環基或6員雜環基、 $-C_1$ - C_6 -烷基-Si(C_1 - C_6 -烷基)₃及 $-C_1$ - C_6 -烷基- C_3 - C_8 -環烷基。

【0023】 本發明涵蓋式(I)化合物之純立體異構體及此等異構體之任何混合物。

【0024】 本文中不涵蓋由與自然法則相抵且熟習此項技術者將因此基於其(his/her)專家知識排除的組合產生的化合物。舉例而言，排除具有三個或更多個相鄰氧原子之環結構。

【0025】 視取代基之性質而定，式(I)化合物可以不同立體異構體形式存在。此等立體異構體為例如鏡像異構體、非鏡像異構體、滯轉異構體或幾何異構體。因此，本發明涵蓋純立體異構體及此等異構體之任何混合

物兩者。當化合物可以處於平衡之兩種或更多種互變異構體形式存在時，藉助於一個互變異構描述對化合物之提及將視為包括所有互變異構體形式。

【0026】視化合物中之雙鍵數而定，本發明之化合物中之任一者亦可以一或多種幾何異構體形式存在。利用關於雙鍵或環之取代基之性質，幾何異構體可以順式(=Z-)或反式(=E-)形式存在。因此，本發明同樣係關於所有幾何異構體及呈所有比例之所有可能的混合物。

【0027】式(I)化合物可適合地呈其游離形式、鹽形式、N-氧化物形式或溶劑合物形式(例如，水合物)。

【0028】視取代基之性質而定，式(I)化合物可以游離化合物及/或其鹽(諸如農業化學上活性鹽)之形式存在。

【0029】農業化學上活性鹽包括無機酸及有機酸之酸加成鹽以及習用鹼之鹽。無機酸之實例為氫鹵酸，諸如氟化氫、氯化氫、溴化氫及碘化氫、硫酸、磷酸及硝酸，以及酸性鹽，諸如硫酸氫鈉及硫酸氫鉀。適用的有機酸包括例如甲酸、碳酸及烷酸，諸如乙酸、三氟乙酸、三氯乙酸及丙酸，以及乙醇酸、硫氰酸、乳酸、丁二酸、檸檬酸、苯甲酸、肉桂酸、草酸、具有6至20個碳原子之飽和或單不飽和或二不飽和脂肪酸、烷基硫酸單酯、烷基磺酸(具有1至20個碳原子之具有直鏈或分支鏈烷基之磺酸)、芳基磺酸或芳基二磺酸(帶有一個或兩個磺酸基之芳族基，諸如苯基及萘基)、烷基磷酸(具有1至20個碳原子之具有直鏈或分支鏈烷基之磷酸)、芳基磷酸或芳基二磷酸(帶有一個或兩個磷酸基之芳族基，諸如苯基及萘基)，其中烷基及芳基可帶有其他取代基，例如對甲苯磺酸、水楊酸、對胺基水楊酸、2-苯氧基苯甲酸、2-乙醯氧基苯甲酸等。

【0030】 式(I)化合物或其鹽之溶劑合物為化合物與溶劑之化學計量組合物。

【0031】 式(I)化合物可以多種結晶及/或非晶形式存在。結晶形式包括未溶合結晶形式、溶劑合物及水合物。

【0032】 在一些實施例中，在上式(I)中， R^4 選自以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、苯甲基、經羥基取代之苯甲基、經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 為氫原子；或 R^4 及 R^5 與其所連接之碳原子一起形成環丙基。

【0033】 在一些實施例中，在上式(I)中， R^4 選自以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、苯甲基、經羥基取代之苯甲基、經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 為氫原子。

【0034】 在一些實施例中，在上式(I)中， R^4 為氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、芳烷基或經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 為氫原子；或 R^4 及 R^5 與其所連接之碳原子一起形成環丙基。

【0035】 在一些實施例中，在上式(I)中， R^4 為氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、芳烷基或經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 為氫原子。

【0036】 適合 R^4 基團之非限制性實例包括揭示於表I.1之行「 R^4 」中之 R^4 基團中之任一者。

【0037】 在一些實施例中，在上式(I)中， R^6 選自由以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -鹵烷基、 C_1 - C_6 -氰基烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_8 -環烷基、苯基、苯甲基、4員雜環基、5員雜環基或6員雜環基、- C_1 - C_6 -烷基-Si(C_1 - C_6 -烷基)₃及- C_1 - C_6 -烷基-環丙基。

【0038】 當 R^6 為4員雜環基、5員雜環基或6員雜環基時，其可為飽

和或部分不飽和雜環基。飽和4員雜環基、5員雜環基或6員雜環基之實例包括(但不限於)：4員環，諸如氮雜環丁基、氧雜環丁基、硫雜環丁基、二氧代硫雜環丁基；5員環，諸如氧代環戊基、1,3-二氧代環戊基、四氫噻吩基、吡咯啉基、吡啶基、咪啶基、三唑啉基、異噁唑啉基、噁唑啉基、噁二唑啉基、噻唑啉基、異噻唑啉基、噻二唑啉基；6員環，諸如哌啶基、六氫噻嗪基、六氫嘧啶基、哌嗪基、三氮雜環己烷基、六氫三嗪基、氧雜環己基、二氧雜環己基、四氫硫代哌喃基、二噻烷基、嗎啉基、1,2-氧氮雜環己烷基、氧硫雜環己烷基、硫代嗎啉基。部分不飽和非芳族雜環基之實例包括(但不限於)：5員環，諸如二氫呋喃基、1,3-二氧雜環戊烯基、二氫噻吩基、吡咯啉基、二氫咪唑基、二氫吡啶基、異噁唑啉基、二氫噁唑基、二氫噻唑基；或6員環，諸如哌喃基、硫代哌喃基、噻嗪基及噻二嗪基。

【0039】 在一些實施例中，在上式(I)中， R^6 選自由以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -鹵烷基、 C_1 - C_6 -氰基烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_8 -環烷基、苯基、苯甲基、氧雜環丁基、硫雜環丁基、二氧代硫雜環丁基、氧代環戊基、氧雜環己基、 $-C_1$ - C_6 -烷基-Si(C_1 - C_6 -烷基)₃及 $-C_1$ - C_6 -烷基-環丙基。

【0040】 在一些實施例中，在上式(I)中， R^6 為氫原子或 C_1 - C_6 -烷基。

【0041】 適合 R^6 基團之非限制性實例包括揭示於表I.1之行「 R^6 」中之 R^6 基團中之任一者。

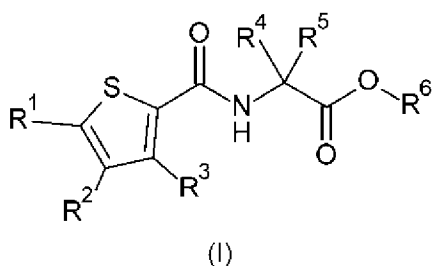
【0042】 在一些實施例中，在上式(I)中， R^1 及 R^2 為氟原子。

【0043】 在一些實施例中，在上式(I)中， R^1 及 R^2 為溴原子。

【0044】 上文指定 R^1 、 R^2 、 R^4 及 R^6 之定義且可以各種方式組合，以提供根據本發明之化合物之子類別。

【0045】 化合物之子類別之非限制性實例包括本文下文中所描述之子類別。

【0046】 在一些實施例(本文中稱為實施例Ia)中，本發明之化合物為式(I)化合物：



其中

R^1 及 R^2 相同且為氯原子或溴原子；

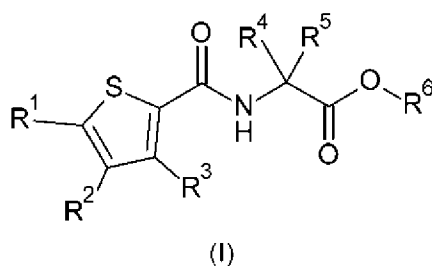
R^3 為甲基；

R^4 選自以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、苯甲基、經經基取代之苯甲基、經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 為氫原子；或

R^4 及 R^5 與其所連接之碳原子一起形成環丙基；

R^6 選自由以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -鹵烷基、 C_1 - C_6 -氰基烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_8 -環烷基、苯基、苯甲基、氧雜環丁基、硫雜環丁基、二氧代硫雜環丁基、氧代環戊基、氧雜環己基、 $-C_1$ - C_6 -烷基-Si(C_1 - C_6 -烷基)₃及 $-C_1$ - C_6 -烷基-環丙基。

【0047】 在一些實施例(本文中稱為實施例Ib)中，本發明之化合物為式(I)化合物：



其中

R^1 及 R^2 相同且為氯原子或溴原子；

R^3 為甲基；

R^4 為氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、芳烷基或經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 為氫原子；或

R^4 及 R^5 與其所連接之碳原子一起形成環丙基；

R^6 為氫原子或 C_1 - C_6 -烷基。

【0048】 在根據實施例Ia及Ib之一些實施例中，當 R^4 及 R^5 與其所連接之碳原子不一起形成環丙基時， R^4 較佳為氫原子、 C_1 - C_4 -烷基、苯甲基或經 C_1 - C_4 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_4 -烷基，更佳地， R^4 為氫、異丙基、異丁基、甲基氫硫基乙基或苯甲基。

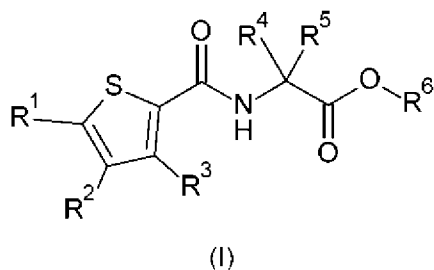
【0049】 在根據實施例Ia及Ib之一些實施例中， R^6 為氫原子或 C_1 - C_4 -烷基，較佳地， R^6 為氫、甲基或乙基。

【0050】 在根據實施例Ia及Ib之一些實施例中， R^1 及 R^2 為氯原子。

【0051】 在根據實施例Ia及Ib之一些實施例中， R^1 及 R^2 為溴原子。

【0052】 在根據實施例Ia及Ib之一些實施例中，當 R^1 及 R^2 為溴原子時， R^4 為氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、芳烷基或經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 為氫原子。

【0053】 在一些實施例中，根據本發明之化合物為式(I)化合物：



其中

R^1 及 R^2 相同且為氯原子或溴原子；

R^3 為甲基；

R^4 為氫原子、 C_1 - C_4 -烷基、苯甲基或經 C_1 - C_4 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_4 -烷基，較佳地， R^4 為氫、異丙基、異丁基、甲基氫硫基乙基或苯甲基，且 R^5 為氫原子；或

R^4 及 R^5 與其所連接之碳原子一起形成環丙基；

R^6 為氫原子或 C_1 - C_4 -烷基，較佳地， R^6 為氫、甲基或乙基。

【0054】 式(I)化合物可用於控制細菌性病害，尤其用於控制由屬於菌屬黃單胞菌之細菌所引起之病害。

【0055】

用於製備式(I)化合物之方法

本發明係關於用於製備式(I)化合物之方法。式(I)化合物可由類似於已知方法(參見其中之參考)之各種途徑及由本文下文及實驗部分中所描述之以下合成途徑中之一或多者來製備。

【0056】

式(I)化合物之通用合成途徑

除非下文中另外指示，否則 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及 R^6 具有如上文針對式(I)化合物所給出之相同意義。

【0057】

(DMC)及丙烷膦酸酐(T3P)。

【0059】當 U^I 表示鹵素原子時，在酸黏合劑存在下有利地進行方法A1。用於實行方法A1之適合酸黏合劑在各情況下均為此等反應習用之所有無機鹼及有機鹼。較佳考慮：鹼金屬碳酸鹽，諸如碳酸鉍、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鉀、碳酸氫鈉；鹼土金屬乙酸鹽，諸如乙酸鈉、乙酸鉀、乙酸鈣；以及三級胺，諸如三甲胺、三乙胺、二異丙基乙胺、三丁胺、N,N-二甲基苯胺、N-甲基哌啶、N,N-二甲基吡啶-4-胺、二氮雜二環辛烷(DABCO)、二氮雜二環-壬烯(DBN)或二氮雜二環十一烯(DBU)；或芳族鹼，諸如吡啶。

【0060】當 U^I 表示 C_1 - C_6 -烷氧基時，方法A1可視情況在諸如三甲基鋁之路易斯酸(Lewis acid)存在下用過量之胺組分進行。

【0061】適當時，方法A1可在鹼存在下，且適當時在溶劑存在下，較佳在無水條件下執行。

【0062】用於實行方法A1之適合溶劑不受特定限制。其可為習用惰性有機溶劑，只要其不溶解與其反應之化合物或展現與其之任何特定相互作用即可。較佳考慮使用以下：視情況經鹵化、脂族、脂環族或芳族烴，諸如石油醚、戊烷、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯、十氫萘、ISOPAR™ E或ISOPAR™ G；氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、1,2-二氯乙烷或三氯乙烷；醚，諸如乙醚、二異丙基醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、2-甲基四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚；腈，諸如乙腈、丙腈、正丁腈或異丁腈或苯甲腈；醯胺，諸如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯苯胺、N-甲基吡咯啶酮或六甲基磷醯三胺；

脲，諸如1,3-二甲基-3,4,5,6-四氫-2(1*H*)-嘧啶酮；酯，諸如乙酸甲酯或乙酸乙酯；亞磺，諸如二甲亞磺；或磺，諸如環丁磺；及其混合物。

【0063】 方法A1可在諸如氫氣或氮氣氛圍之惰性氛圍中執行。當實行方法A1時，每莫耳式(IV)化合物可採用1莫耳或過量之式(V)化合物及1至5莫耳鹼。亦有可能採用其他比率之反應組分。藉由已知方法實行處理。

【0064】 式(V)化合物為可商購的，或可藉由熟知方法製備。

【0065】 式(IV)化合物(其中 U^1 表示羥基)為可商購的可藉由諸如鹼性水解之熟知方法由式(IV)化合物(其中 U^1 表示 C_1 - C_6 -烷氧基)來製備或可藉由已知方法製備(*Beilstein J. Org. Chem.* 2007, 3, 第23期)。

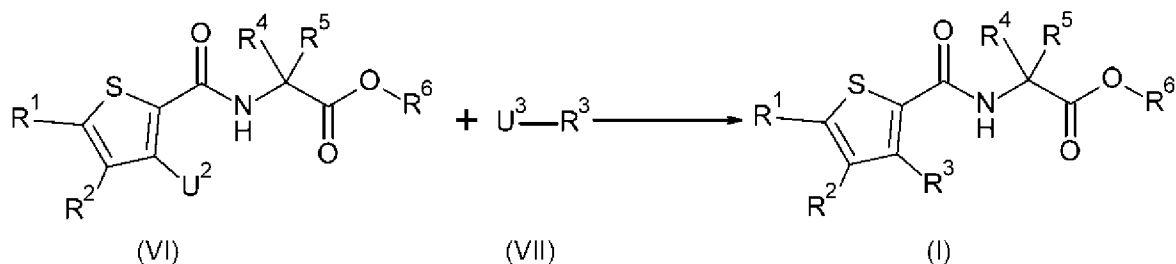
【0066】 式(IV)化合物(其中 U^1 表示鹵素)為可商購的或可藉由熟知方法由式(IV)化合物(其中 U^1 表示羥基)來製備。

【0067】 式(IV)化合物(其中 U^1 表示 C_1 - C_6 -烷氧基)可藉由熟知方法由式(IV)化合物(其中 U^1 表示羥基)來製備。

【0068】

方法B1

如本文中所定義之式(I)化合物可藉由包含以下步驟之方法B1來製備：使式(VI)化合物或其鹽中之一者與式(VII)化合物或其鹽中之一者反應，如以下反應流程所說明：



方法B1

其中 U^2 為溴原子、碘原子、甲磺酸酯基團、甲苯磺酸酯基團或三氟甲磺酸酯基團且 U^3 為諸如硼酸之硼衍生物、硼酸酯衍生物、三氟硼酸鉀衍生物或可由1至2個配位體錯合之鹵化金屬，諸如鹵化鎂或鹵化鋅，

其限制條件為當 R^1 及 R^2 為溴原子時， U^2 不為溴原子。

【0069】 方法B1可根據已知方法在諸如鈮之過渡金屬催化劑存在下，且適當時在膦配位體或N-雜環碳烯配位體存在下，適當時在鹼存在下且適當時在溶劑存在下執行(WO2012054721, *Angew. Chem. Int. Ed.* 2017, 56, 1581, *Angew. Chem. Int. Ed.* 2017, 56, 7078，及其中所引用之參考)。

【0070】 方法B1可在諸如金屬鹽或錯合物之催化劑之存在下實行。出於此目的，適合金屬衍生物為過渡金屬催化劑，諸如鈮。出於此目的，適合金屬鹽或錯合物為例如氯化鈮、乙酸鈮、肆(三苯基膦)鈮(0)、雙(二亞苯甲基丙酮)鈮(0)、參(二亞苯甲基丙酮)二鈮(0)、雙(三苯基膦)二氯化鈮(II)、[1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵]二氯化鈮(II)、雙(苯烯丙基)二氯化二鈮(II)、雙(烯丙基)二氯化二鈮(II)、[1,1'-雙(二-第三丁基膦基)二茂鐵]二氯化鈮(II)、二- μ -碘雙(三-第三丁基膦基)二鈮(I)或二- μ -溴雙(三-第三丁基膦基)二鈮(I)。

【0071】 亦有可能藉由向鈮鹽及配位體或鹽之反應物中單獨添加諸如以下而在反應混合物中產生鈮錯合物：三乙基膦、三-第三丁基膦、三-第三丁基膦四氟硼酸鹽、三環己基膦、2-(二環己基膦基)聯二苯、2-(二-第三丁基膦基)聯二苯、2-(二環己基膦基)-2'-(N,N-二甲胺基)聯二苯、2-(第三丁基膦基)-2'-(N,N-二甲胺基)聯二苯、2-二-第三丁基膦基-2',4',6'-三異丙基聯二苯、2-二環己基膦基-2',4',6'-三異丙基聯二苯、2-二環己基

膦基-2,6'-二甲氧基聯二苯、2-二環己基膦基-2',6'-二異丙氧基聯二苯、三苯基-膦、參-(鄰甲苯基)膦、3-(二苯基膦基)苯磺酸鈉、參-2-(甲氧基-苯基)膦、2,2'-雙(二苯基膦基)-1,1'-聯萘、1,4-雙(二苯基膦基)丁烷、1,2-雙(二苯基膦基)乙烷、1,4-雙(二環己基膦基)丁烷、1,2-雙(二環己基膦基)-乙烷、2-(二環己基膦基)-2'-(N,N-二甲基胺基)-聯二苯、1,1'-雙(二苯基膦基)-二茂鐵、(R)-(-)-1-[(S)-2-二苯基-膦基]二茂鐵基]乙基二環己基膦、參-(2,4-第三丁基-苯基)亞磷酸鹽、二(1-金剛烷基)-2-嗎啉基苯基膦或1,3-雙(2,4,6-三甲基苯基)咪唑鎘氯化物。

【0072】 亦有利的選擇來自商業目錄之適當的催化劑及/或配位體，諸如Strem Chemicals之「有機合成之金屬催化劑(Metal Catalysts for Organic Synthesis)」或Strem Chemicals之「磷配位體及化合物(Phosphorous Ligands and Compounds)」。

【0073】 用於實行方法B1之適合鹼可為此等反應習用之無機鹼及有機鹼。較佳考慮使用以下：鹼土金屬或鹼金屬氫氧化物，諸如氫氧化鈉、氫氧化鈣、氫氧化鉀或其他氫氧化銨衍生物；鹼土金屬、鹼金屬或銨氟化物，諸如氟化鉀、氟化銻或四丁基氟化銨；鹼土金屬或鹼金屬碳酸鹽，諸如碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鉀、碳酸氫鈉或碳酸銻；鹼金屬或鹼土金屬乙酸鹽，諸如乙酸鈉、乙酸鋰、乙酸鉀或乙酸鈣；鹼金屬或鹼土金屬磷酸鹽，諸如磷酸三鉀鹼；鹼金屬醇化物，諸如第三丁醇鉀或第三丁醇鈉；三級胺，諸如三甲胺、三乙胺、三丁胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二環己基甲胺、N,N-二異丙基乙胺、N-甲基哌啶、N,N-二甲胺基吡啶、二氮雜二環辛烷(DABCO)、二氮雜二環壬烯(DBN)或二氮雜二環十一烯(DBU)；以及芳族鹼，諸如吡啶、甲基吡啶、二甲基吡啶或三甲基吡啶。

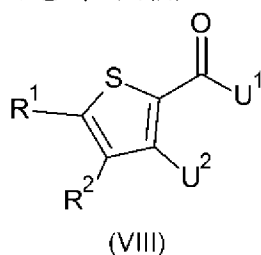
【0074】 用於實行方法B1之適合溶劑可為習用惰性有機溶劑。較佳考慮使用以下：視情況鹵素原子化脂族、脂環族或芳族烴，諸如石油醚、戊烷、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚，諸如乙醚、二異丙基醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、2-甲基四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚；腈，諸如乙腈、丙腈、正丁腈或異丁腈或苯甲腈；醯胺，諸如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯苯胺、N-甲基吡咯啉酮或六甲基磷醯三胺；脲，諸如1,3-二甲基-3,4,5,6-四氫-2(1H)-嘓啉酮；酯，諸如乙酸甲酯或乙酸乙酯；亞砒，諸如二甲亞砒；或砒，諸如環丁砒；及其混合物。

【0075】 亦可有利的利用諸如水或醇之共溶劑實行方法B1，該醇諸如甲醇、乙醇、丙醇、異丙醇或第三丁醇。

【0076】 方法B1可在諸如氫氣或氮氣氛圍之惰性氛圍中執行。當實行方法B1時，每莫耳式(VI)化合物可採用1莫耳或過量之式(VII)化合物及1至5莫耳鹼及0.01至20莫耳百分數之鈹錯合物。亦有可能採用其他比率之反應組分。藉由已知方法實行處理。

【0077】 式(VII)化合物為可商購的或可藉由熟知方法製備。

【0078】 式(VI)化合物可藉由使式(VIII)化合物與式(V)化合物在如結合方法A1所描述之條件中反應來製備：



其中 U^2 及 U^1 如本文中所定義。

【0079】 式(VIII)化合物(其中 U^2 為氯原子、溴原子或碘原子)為可商購的或可藉由熟知方法用與製備式(IV)化合物所揭示之反應條件類似的反應條件來製備。

【0080】 式(VIII)化合物(其中 U^2 為甲磺酸酯基團、甲苯磺酸酯基團或三氟甲磺酸酯基團)可藉由熟知方法由帶有 U^2 位置處之羟基的對應化合物來製備。

【0081】

方法C1

如本文中所定義之式(I)化合物可藉由方法C1藉由執行溴化或氯化反應由式(IX)化合物或其鹽中之一者來製備，如以下反應流程中所說明：



方法C1

其中 U^4 為氫原子、氯原子或溴原子且 U^5 為氫原子、氯原子或溴原子，其限制條件為 U^4 或 U^5 中之至少一者為氫原子。

【0082】 可根據已知方法(WO2008109786，WO2007098356)實行方法C1。

【0083】 方法C1在溴化劑或氯化劑存在下且適當時在溶劑存在下執行。

【0084】 用於實行方法C1之適合溴化或氯化劑不受特定限制，只要

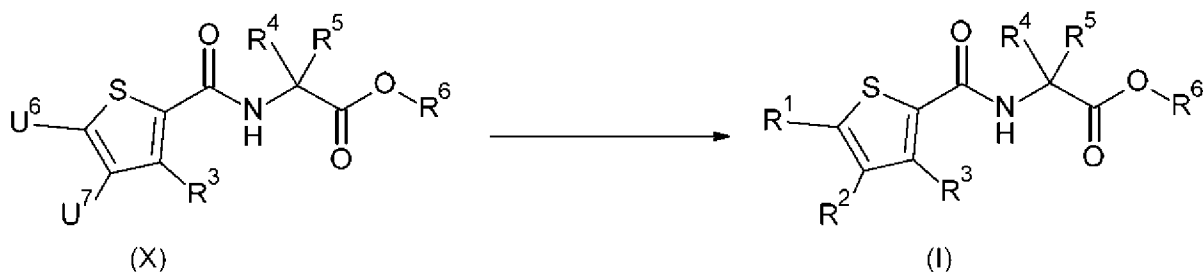
其用於溴化或氯化。溴化劑之實例包括溴、N-溴代丁二醯亞胺及1,3-二溴-5,5-二甲基-2,4-咪唑啉二酮。氯化劑之實例包括N-氯代二醯亞胺、硫醯氯及1,3-二氯-5,5-二甲基-2,4-咪唑啉二酮。

【0085】 用於實行方法C1之適合溶劑不受特定限制。其可為習用惰性有機溶劑，只要其不溶解與其反應之化合物或展現與其之任何特定相互作用即可。適合溶劑可為例如結合方法A1所揭示之溶劑。為實行方法C1，亦可有利的使用諸如乙酸之有機酸作為溶劑或共溶劑。

【0086】

方法D1

如本文中所定義之式(I)化合物可藉由包含以下步驟之方法D1來製備：執行式(X)化合物或其鹽中之一者之重氮化，隨後進行芳族取代以提供式(I)化合物，如以下反應流程中所說明：



方法D1

其中U⁶為胺基、氯原子或溴原子，且U⁷為胺基、氯原子或溴原子，其限制條件為U⁶或U⁷中之至少一者為胺基。

【0087】 方法D1可根據已知方法(The Chemistry of diazonium and diazo groups; Saul Patai; Wiley-Interscience; 1978; 288至280及645至657; Account of Chemical Research (2018), 51, 496，及其中所引用之參考)實行。

【0088】如本文中所定義之式(X)化合物或其鹽中之一者可藉由包含以下步驟之方法製備：使式(XI)化合物或其鹽中之一者去保護，如以下反應流程中所說明：



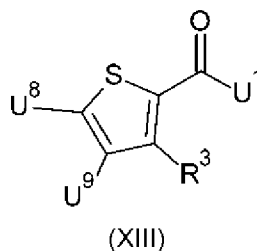
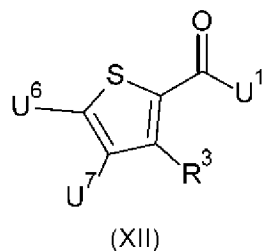
其中 U^8 為受保護之胺基、氯原子或溴原子，且 U^7 為受保護之胺基、氯原子或溴原子，其限制條件為 U^8 或 U^9 中之至少一者為受保護之胺基， U^6 為胺基、氯原子或溴原子，且 U^7 為胺基、氯原子或溴原子，其限制條件為 U^6 或 U^7 中之至少一者為胺基。

【0089】胺基之保護基之實例包括：苯甲基、4-甲氧基苯甲基、烯丙基、未經取代或經取代之 C_1 - C_6 -烷基磺醯基、三氟甲基磺醯基、未經取代或經取代之苯磺醯基、未經取代或經取代之 C_1 - C_6 -烷氧基羰基、未經取代或經取代之苯甲氧基羰基、烯丙氧基羰基、乙醯基或三氟乙醯基。

【0090】去保護方法可根據用於移除保護基之已知方法(Greene's Protective Groups in Organic Synthesis; Peter G. M. Wuts; Wiley; 第五版; 2014; 895至1194)實行。舉例而言，第三丁氧基羰基及苯甲氧基羰基保護基可在酸性介質中(例如，用氫氯酸或三氟乙酸)移除。苯甲基保護基可在催化劑(例如鈀/活性碳)存在下以氫解方式用氫移除。三氟乙醯基可在鹼性介質中(例如，用碳酸鉀或氫氧化鋰)移除。

【0091】式(X)化合物可由式(XII)化合物或其鹽中之一者製備且式(XI)化合物可由式(XIII)化合物或其鹽中之一者藉由與式(V)化合物在如方

法A1中所描述之條件下反應來製備：



其中U⁶、U⁷、U⁸及U⁹如本文中所定義，U¹為鹵素原子、羥基或C₁-C₆-烷氧基。

【0092】 式(XII)化合物及式(XIII)化合物為可商購的或可藉由熟知方法用與製備式(IV)化合物所揭示之反應條件類似的反應條件來製備。

【0093】 式(I)化合物或其鹽中之一者(其中R⁶表示氫原子)可藉由諸如鹼性水解之熟知方法由式(I)化合物(其中R⁶表示以下：C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷基、C₁-C₆-氰基烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-環烷基、芳基、芳烷基、4員雜環基、5員雜環基或6員雜環基、-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃或-C₁-C₆-烷基-環丙基)來製備。

【0094】 式(I)化合物(其中R⁶表示以下：C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷基、C₁-C₆-氰基烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-環烷基、芳基、芳烷基、4員雜環基、5員雜環基或6員雜環基、-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃或-C₁-C₆-烷基-環丙基)可藉由熟知方法由式(I)化合物或其鹽中之一者(其中R⁶表示氫原子)來製備。

【0095】 如本文中所揭示之中間物可在控制細菌及/或真菌方面有效。

【0096】

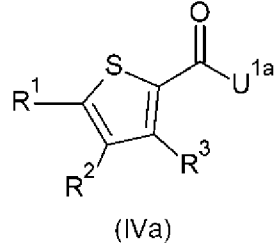
用於製備式(I)化合物之中間物

除非下文中另外指示，否則R¹、R²、R³、R⁴、R⁵及R⁶具有如上文針

對式(I)化合物所給出之相同意義。

【0097】 本發明亦係關於用於製備式(I)化合物之中間物。

【0098】 提供式(IVa)化合物：



其中

R^1 及 R^2 相同且為氯原子或溴原子；

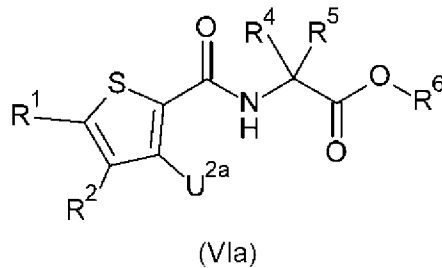
R^3 為甲基；

U^{1a} 為羥基或 C_1 - C_6 -烷氧基，

其限制條件為式(IVa)化合物不表示：

- 4,5-二溴-3-甲基噻吩-2-甲酸乙酯[2088257-63-8]，
- 4,5-二氯-3-甲基噻吩-2-甲酸[854626-34-9]，
- 4,5-二溴-3-甲基噻吩-2-甲酸[854626-32-7]，
- 4,5-二氯-3-甲基噻吩-2-甲酸甲酯[854626-27-0]及
- 4,5-二溴-3-甲基噻吩-2-甲酸甲酯[648412-53-7]。

【0099】 提供式(VIa)化合物：



其中

R^1 及 R^2 相同且為氯原子或溴原子；

R^4 選自以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、芳烷基、經經基取代之芳烷基、經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 為氫原子；或

R^4 及 R^5 與其所連接之碳原子一起形成環丙基；

R^6 選自由以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -鹵烷基、 C_1 - C_6 -氰基烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_8 -環烷基、芳基、芳烷基、4員雜環基、5員雜環基或6員雜環基、 $-C_1$ - C_6 -烷基-Si(C_1 - C_6 -烷基)₃及 $-C_1$ - C_6 -烷基- C_3 - C_8 -環烷基；

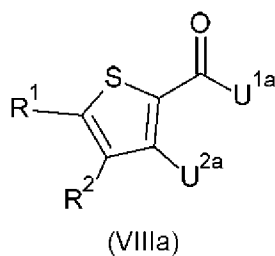
U^{2a} 為溴原子、碘原子、甲磺酸酯基團、甲苯磺酸酯基團或三氟甲磺酸酯基團，

其中 R^4 選自以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、芳烷基、經經基取代之芳烷基、經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 在 R^6 為氫原子或 C_1 - C_6 -烷基時為氫原子；及

其限制條件為當 R^1 及 R^2 為溴原子時， U^{2a} 不為溴原子。

【0100】 發現式(VI)化合物(其中 U^{2a} 為溴原子或碘原子)在控制真菌及/或細菌方面為有效的。

【0101】 提供式(VIIIa)化合物：



其中

R^1 及 R^2 相同且為氯原子或溴原子；

U^{1a} 為經基或 C_1 - C_6 -烷氧基；

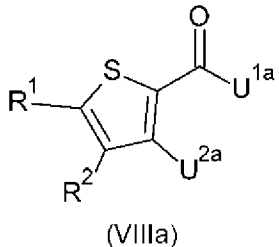
U^{2a} 為溴原子、碘原子、甲磺酸酯基團、甲苯磺酸酯基團或三氟甲磺

酸酯基團，

其限制條件為當 R^1 及 R^2 為溴原子時， U^{2a} 不為溴原子；及其限制條件為式(VIIIa)化合物不表示：

- 4,5-二溴-3-氯噻吩-2-甲酸甲酯[1501789-47-4]，
- 4,5-二溴-3-碘噻吩-2-甲酸[854626-46-3]，
- 4,5-二溴-3-氯噻吩-2-甲酸[503308-99-4]及
- 4,5-二溴-3-氯噻吩-2-甲酸乙酯[503308-98-3]。

【0102】 提供式(VIIIa)化合物：



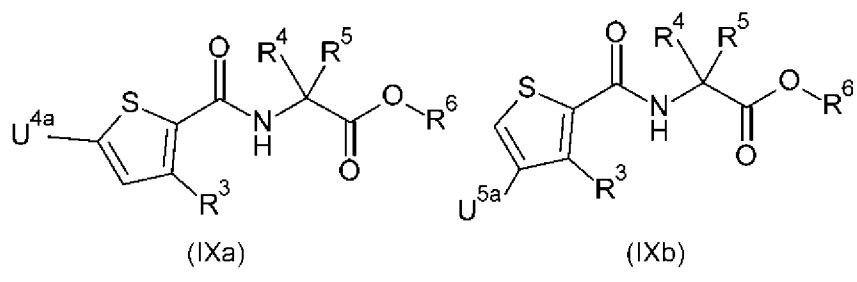
其中

R^1 及 R^2 相同且為氯原子或溴原子；

U^{1a} 為羥基或 C_1 - C_6 -烷氧基；

U^{2a} 為甲磺酸酯基團、甲苯磺酸酯基團或三氟甲磺酸酯基團。

【0103】 提供式(IXa)及(IXb)化合物：



其中

R^3 為甲基；

R^4 選自以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、芳烷基、經羥基取代

之芳烷基、經C₁-C₆-烷基氫硫基取代之C₁-C₆-烷基，且R⁵為氫原子；或

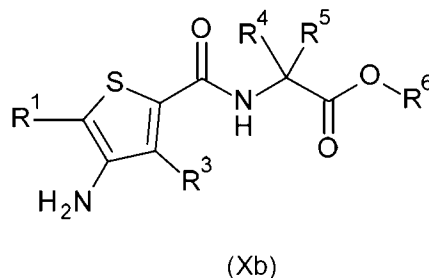
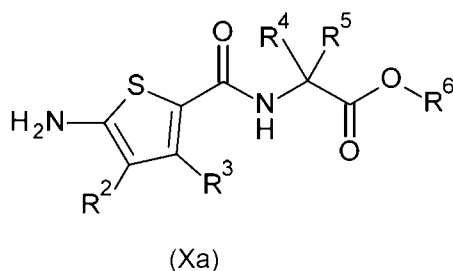
R⁴及R⁵與其所連接之碳原子一起形成環丙基；

R⁶選自由以下組成之群：氫原子、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷基、C₁-C₆-氰基烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-環烷基、芳基、芳烷基、4員雜環基、5員雜環基或6員雜環基、-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃及-C₁-C₆-烷基-C₃-C₈-環烷基；

U^{4a}為氯原子或溴原子；及

U⁵為氯原子或溴原子。

【0104】 提供式(Xa)及(Xb)化合物：



R¹或R²為氯原子或溴原子；

R³為甲基；

R⁴選自由以下組成之群：氫原子、C₁-C₆-烷基、芳烷基、經經基取代之芳烷基、經C₁-C₆-烷基氫硫基取代之C₁-C₆-烷基，且R⁵為氫原子；或

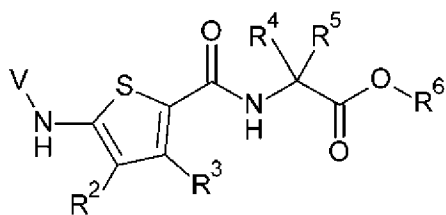
R⁴及R⁵與其所連接之碳原子一起形成環丙基；

R⁶選自由以下組成之群：氫原子、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷基、C₁-C₆-氰基烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-環烷基、芳基、芳烷基、4員雜環基、5員雜環基或6員雜環基、-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃及-C₁-C₆-烷基-C₃-C₈-環烷基；

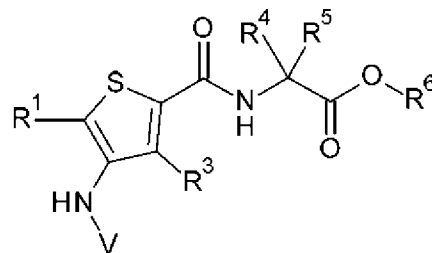
其中R⁴選自由以下組成之群：氫原子、C₁-C₆-烷基、芳烷基、經經基取代之芳烷基、經C₁-C₆-烷基氫硫基取代之C₁-C₆-烷基，且R⁵在R⁶為氫原

子或C₁-C₆-烷基時為氫原子。

【0105】 提供式(XIa)及(XIb)化合物：



(XIa)



(XIb)

其中

R¹或R²為氯原子或溴原子；

R³為甲基；

R⁴選自以下組成之群：氫原子、C₁-C₆-烷基、芳烷基、經經基取代之芳烷基、經C₁-C₆-烷基氫硫基取代之C₁-C₆-烷基，且R⁵為氫原子；或

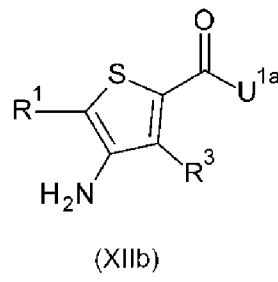
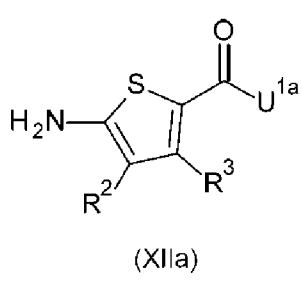
R⁴及R⁵與其所連接之碳原子一起形成環丙基；

R⁶選自由以下組成之群：氫原子、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷基、C₁-C₆-氰基烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-環烷基、芳基、芳烷基、4員雜環基、5員雜環基或6員雜環基、-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃及-C₁-C₆-烷基-C₃-C₈-環烷基；

V為苯甲基、4-甲氧基苯甲基、烯丙基、未經取代或經取代之C₁-C₆-烷氧基羰基、未經取代或經取代之苯甲氧基羰基、烯丙氧基羰基、乙醯基或三氟乙醯基；

其中R⁴選自以下組成之群：氫原子、C₁-C₆-烷基、芳烷基、經經基取代之芳烷基、經C₁-C₆-烷基氫硫基取代之C₁-C₆-烷基，且R⁵在R⁶為氫原子或C₁-C₆-烷基時為氫原子。

【0106】 提供式(XIIa)及(XIIb)化合物：



其中

R¹或R²為氯原子或溴原子；

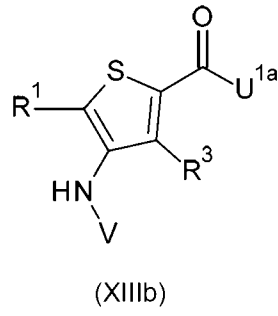
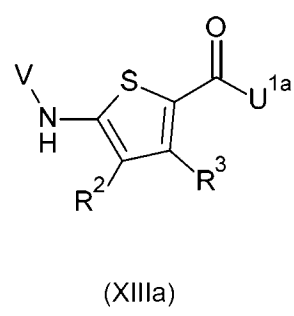
R³為甲基；

U^{1a}為羥基或C₁-C₆-烷氧基，

其限制條件為式(XIIa)化合物不表示：

- 5-胺基-4-溴-3-甲基噻吩-2-甲酸乙酯[851443-15-7]。

【0107】 提供式(XIIIa)及(XIIIb)化合物：



其中

R¹或R²為氯原子或溴原子；

R³為甲基；

V為苯甲基、4-甲氧基苯甲基、烯丙基、未經取代或經取代之C₁-C₆-烷氧基羰基、未經取代或經取代之苯甲氧基羰基、烯丙氧基羰基、乙醯基或三氟乙醯基；及

U^{1a}為羥基或C₁-C₆-烷氧基，

其限制條件為式(XIIIa)化合物不表示：

- 5-乙醯胺基-4-溴-3-甲基噻吩-2-甲酸乙酯[851444-63-8]。

【0108】 所揭示之中間物可在控制細菌及/或真菌方面有效。

【0109】

組合物及調配物

本發明另外係關於一種組合物，尤其用於控制由菌屬黃單胞菌之細菌所引起之植物病害的組合物，其包含一或多種如本文上文所揭示之式(I)化合物及其任何混合物。

【0110】 組合物通常包含至少一種式(I)化合物及至少一種農業上適合的助劑，例如載劑及/或界面活性劑。

【0111】 載劑為固體或液體、天然或合成的、有機或無機物質，其一般為惰性的。載劑一般改良化合物對例如植物、植物部分或種子之施加。適合固體載劑之實例包括(但不限於)：銨鹽；天然石粉，諸如高嶺土、黏土、滑石、白堊、石英、綠坡縷石、蒙脫石及矽藻土；及合成石粉，諸如經細微粉碎之二氧化矽、氧化鋁及矽酸鹽。通常適用於製備顆粒之固體載劑之實例包括(但不限於)：碾碎及分級之天然岩石，諸如方解石、大理石、浮石、海泡石及白雲石；合成之無機及有機粉末顆粒；及有機材料顆粒，諸如紙張、鋸屑、椰子殼、玉米穗軸及菸草梗。適合液體載劑之實例包括(但不限於)水、有機溶劑及其組合。適合溶劑之實例包括極性及非極性有機化學液體，例如來自芳族及非芳族烴類(諸如環己烷、烷烴、烷基苯、二甲苯、甲苯、烷基萘、氯化芳族物或氯化脂族烴，諸如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷)；醇及多元醇(其亦可視情況經取代、醚化及/或酯化，諸如丁醇或乙二醇)；酮(諸如丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮或環己酮)；酯(包括脂肪及油)及(聚)醚；未經取代及經取代之胺；醯胺(諸如二甲基甲醯胺)；內醯胺(諸如N-烷基吡咯啉酮)及內酯；礬及亞礬(諸如二

甲亞碲)。載劑亦可為液化氣態填充劑(亦即，在標準溫度下及在標準壓力下為氣態的液體)，例如氣溶膠推進劑，諸如鹵代烴、丁烷、丙烷、氮及二氧化碳。載劑之量通常範圍介於組合物之1至99.99重量%，較佳5至99.9重量%，更佳10至99.5重量%，且最佳20至99重量%。

【0112】 界面活性劑可為離子性(陽離子性或陰離子性)或非離子性界面活性劑，諸如離子性或非離子性乳化劑、泡沫形成物、分散劑、濕潤劑及其任何混合物。適合界面活性劑之實例包括(但不限於)：聚丙烯酸之鹽；木質磺酸之鹽；酚磺酸或萘磺酸之鹽；乙烯及/或環氧丙烷與脂肪醇、脂肪酸或脂肪胺之聚縮合物(聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，例如烷基芳基聚二醇醚)；經取代之酚(較佳為烷基酚或芳基酚)；磺化丁二酸酯之鹽；牛磺酸衍生物(較佳為牛磺酸烷酯)；聚乙氧基化醇或酚之磷酸酯；多元醇之脂肪酯及含有硫酸酯、磺酸酯及磷酸酯之化合物之衍生物(例如烷基磺酸酯、硫酸烷酯、芳基磺酸酯)及蛋白質水解產物；木質亞硫酸鹽廢液；及甲基纖維素。界面活性劑通常在本發明之化合物及/或載劑不溶於水且用水進行施加時使用。接著，界面活性劑之量通常範圍介於組合物之5至40重量%。

【0113】 適合助劑之其他實例包括：拒水劑；乾燥劑；黏合劑(黏著劑、增黏劑、固定劑，諸如羧甲基纖維素；呈粉末、顆粒或膠乳形式之天然及合成聚合物，諸如阿拉伯膠、聚乙烯醇及聚乙酸乙烯酯；諸如腦磷脂及卵磷脂之天然磷脂及合成磷脂；聚乙烯吡咯啉酮；及泰勒纖維素(tylose))；增稠劑；穩定劑(例如，低溫穩定劑、防腐劑、抗氧化劑、光穩定劑，或改良化學及/或物理穩定性之其他試劑)；染料或顏料(諸如無機顏料，例如氧化鐵、氧化鈦及普魯士藍(Prussian Blue)；有機染料，例如

茜素(alizarin)、偶氮基及金屬酞菁染料)；消泡劑(例如，聚矽氧消泡劑及硬脂酸鎂)；防腐劑(例如，二氯酚及苯甲醇半縮甲醛)；輔助增稠劑(纖維素衍生物、丙烯酸衍生物、三仙膠(xanthan)、經改質黏土及細微粉碎之二氧化矽)；黏著劑；赤黴素及處理助劑；礦物及植物油；香料；蠟；營養素(包括微量營養素，諸如鐵、錳、硼、銅、鈷、鋁及鋅之鹽)；保護性膠體；搖溶性物質；滲透劑；掩蔽劑；及錯合物形成劑。

【0114】 助劑之選擇與本發明化合物之預期施加模式及/或物理特性有關。此外，助劑可經選擇以向組合物或由其製備之使用形式賦予特定特性(技術、物理及/或生物特性)。助劑之選擇可允許針對特定需求定製組合物。

【0115】 本發明之組合物可呈任何習用形式，諸如溶液(例如，水溶液)、乳液、可濕潤粉末、水基及油基懸浮液、粉末、粉塵、糊狀物、可溶性粉末、可溶性顆粒、用於散佈之顆粒、懸乳劑濃縮物、浸漬有本發明化合物之天然或合成產物、肥料以及聚合物質中之微膠囊。本發明之化合物可以懸浮、乳化或溶解形式存在。

【0116】 可將本發明之組合物作為備用調配物提供給終端使用者，亦即組合物可藉由適合裝置(諸如噴灑或撒粉裝置)直接施加至植物或種子。替代地，可將組合物以濃縮物之形式提供給終端使用者，其在使用之前必須經稀釋，較佳地用水稀釋。

【0117】 本發明之組合物可以習知方式，例如藉由使本發明之化合物與諸如上文所揭示之一或多種適合助劑混合來製備。

【0118】 根據本發明之組合物一般含有0.01至99重量%、0.05至98重量%，較佳0.1至95重量%，更佳0.5至90重量%，最佳1至80重量%之本

發明化合物。有可能，組合物包含兩種或更多種本發明化合物。在此情況下，所概述範圍係指本發明化合物之總量。

【0119】

混合物/組合

本發明之化合物及組合物可與如殺真菌劑、殺菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、殺蟲劑、除草劑、肥料、生長調節劑、安全劑及/或訊息化合物之其他活性成分混合。此可使得活性範圍變寬或防止耐藥性產生。已知殺真菌劑、殺蟲劑、殺蟎劑、殺線蟲劑及殺菌劑之實例揭示於Pesticide Manual，第17版中。

【0120】 可與本發明之化合物及組合物混合的尤佳殺真菌劑之實例為：

1)麥角固醇生物合成之抑制劑，例如(1.001)環克座(cyproconazole)、(1.002)待克利(difenoconazole)、(1.003)依普座(epoxiconazole)、(1.004)環醯菌胺(fenhexamid)、(1.005)苯鏽啉(fenpropidin)、(1.006)芬普福(fenpropimorph)、(1.007)胺苯吡菌酮(fenpyrazamine)、(1.008)氟喹唑(fluquinconazole)、(1.009)護汰芬(flutriafol)、(1.010)依滅列(imazalil)、(1.011)依滅列硫酸鹽(imazalil sulfate)、(1.012)種菌唑(ipconazole)、(1.013)滅特座(metconazole)、(1.014)邁克尼(myclobutanil)、(1.015)巴克素(paclobutrazol)、(1.016)撲克拉(prochloraz)、(1.017)普克利(propiconazole)、(1.018)丙硫菌唑(prothioconazole)、(1.019)啉菌噁唑(pyrisoxazole)、(1.020)螺環菌胺(spiroxamine)、(1.021)得克利(tebuconazole)、(1.022)四克利(tetraconazole)、(1.023)三泰隆(triadimenol)、(1.024)三得芬

(tridemorph)、(1.025)滅菌唑(triticonazole)、(1.026) (1R,2S,5S)-5-(4-氯苯甲基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)環戊醇、(1.027) (1S,2R,5R)-5-(4-氯苯甲基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)環戊醇、(1.028) (2R)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.029) (2R)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.030) (2R)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.031) (2S)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1R)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.032) (2S)-2-(1-氯環丙基)-4-[(1S)-2,2-二氯環丙基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.033) (2S)-2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.034) (R)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.035) (S)-[3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.036) [3-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,2-噁唑-4-基](吡啶-3-基)甲醇、(1.037) 1-({(2R,4S)-2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二氧環戊-2-基}甲基)-1H-1,2,4-三唑、(1.038) 1-({(2S,4S)-2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-4-甲基-1,3-二氧環戊-2-基}甲基)-1H-1,2,4-三唑、(1.039) 硫代氰酸1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基酯、(1.040) 硫代氰酸1-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基酯、(1.041) 硫代氰酸1-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑-5-基酯、(1.042) 2-[2R,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.043) 2-

[2R,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.044) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.045) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.046) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.047) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.048) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.049) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.050) 2-[1-(2,4-二氯苯基)-5-羥基-2,6,6-三甲基庚-4-基]-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.051) 2-[2-氯-4-(2,4-二氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丙-2-醇、(1.052) 2-[2-氯-4-(4-氯苯氧基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.053) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)丁-2-醇、(1.054) 2-[4-(4-氯苯氧基)-2-(三氟甲基)苯基]-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基)戊-2-醇、(1.055) 氯氟醚菌唑(Mefentrifluconazole)、(1.056) 2-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.057) 2-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.058) 2-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-硫酮、(1.059) 5-(4-氯苯甲基)-2-(氯甲基)-2-甲基-1-(1H-1,2,4-三唑-1-基甲基)環戊醇、(1.060) 5-(烯丙基氫硫基)-1-{[3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-

基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.061) 5-(烯丙基氫硫基)-1-{[rel(2R,3R)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.062) 5-(烯丙基氫硫基)-1-{[rel(2R,3S)-3-(2-氯苯基)-2-(2,4-二氟苯基)環氧乙烷-2-基]甲基}-1H-1,2,4-三唑、(1.063) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]氫硫基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.064) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(2,2,2-三氟乙氧基)苯基]氫硫基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.065) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(2,2,3,3-四氟丙氧基)苯基]氫硫基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.066) N'-(2,5-二甲基-4-{[3-(五氟乙氧基)苯基]氫硫基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.067) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(1,1,2,2-四氟乙基)氫硫基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.068) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(2,2,2-三氟乙基)氫硫基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.069) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(2,2,3,3-四氟丙基)氫硫基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.070) N'-(2,5-二甲基-4-{3-[(五氟乙基)氫硫基]苯氧基}苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.071) N'-(2,5-二甲基-4-苯氧基苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.072) N'-(4-{[3-(二氟甲氧基)苯基]氫硫基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.073) N'-(4-{3-[(二氟甲基)氫硫基]苯氧基}-2,5-二甲基苯基)-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.074) N'-[5-溴-6-(2,3-二氫-1H-茛-2-基氧基)-2-甲基吡啶-3-基]-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.075) N'-{4-[(4,5-二氯-1,3-噻唑-2-基)氧基]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.076) N'-{5-溴-6-[(1R)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啶-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.077) N'-{5-溴-6-[(1S)-1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡

啉-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.078) N'-{5-溴-6-[(順-4-異丙基環己基)氧基]-2-甲基吡啉-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.079) N'-{5-溴-6-[(反式-4-異丙基環己基)氧基]-2-甲基吡啉-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.080) N'-{5-溴-6-[1-(3,5-二氟苯基)乙氧基]-2-甲基吡啉-3-基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.081)依普芬三氟康納唑(Ipfentrifluconazole)。

2)錯合物I或II處之呼吸鏈之抑制劑，例如：(2.001)苯并烯氟菌唑(benzovindiflupyr)、(2.002)必殺吩(bixafen)、(2.003)白克列(boscalid)、(2.004)萎鏽靈(carboxin)、(2.005)氟吡菌醯胺(flupyram)、(2.006)福多寧(flutolanil)、(2.007)氟唑菌醯胺(fluxapyroxad)、(2.008)福拉比(furametpyr)、(2.009)艾索非他米(Isofetamid)、(2.010)異吡瑞沙(isopyrazam) (反式-差向異構的對映異構體1R,4S,9S)、(2.011)異吡瑞沙(反式-差向異構的對映異構體1S,4R,9R)、(2.012)異吡瑞沙(反式-差向異構的外消旋體1RS,4SR,9SR)、(2.013)異吡瑞沙(順式-差向異構的外消旋體1RS,4SR,9RS與反式-差向異構的外消旋體1RS,4SR,9SR之混合物)、(2.014)異吡瑞沙(順式-差向異構的對映異構體1R,4S,9R)、(2.015)異吡瑞沙(順式-差向異構的對映異構體1S,4R,9S)、(2.016)異吡瑞沙(順式-差向異構的外消旋體1RS,4SR,9RS)、(2.017)氟唑菌苯胺(penflufen)、(2.018)吡噻菌胺(penthiopyrad)、(2.019)氟唑菌醯羥胺(pydiflumetofen)、(2.020)吡唑嘧啉(pyraziflumid)、(2.021)氟唑環菌胺(sedaxane)、(2.022) 1,3-二甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基)-1H-吡啉-4-甲醯胺、(2.023) 1,3-二甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-基]-1H-吡啉-4-甲醯胺、(2.024) 1,3-二甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茚-4-

基]-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.025) 1-甲基-3-(三氟甲基)-N-[2'-(三氟甲基)聯二苯-2-基]-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.026) 2-氟-6-(三氟甲基)-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)苯甲醯胺、(2.027) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.028) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3R)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.029) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[(3S)-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.030) 氟茛啉胺(fluidapyr)、(2.031) 3-(二氟甲基)-N-[(3R)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.032) 3-(二氟甲基)-N-[(3S)-7-氟-1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基]-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.033) 5,8-二氟-N-[2-(2-氟-4-{[4-(三氟甲基)吡啶-2-基]氧基}苯基)乙基]喹啉-4-胺、(2.034) N-(2-環戊基-5-氟苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.035) N-(2-第三丁基-5-甲基苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.036) N-(2-第三丁基苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.037) N-(5-氯-2-乙基苯基)-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.038) 異氟醯胺(isoflucypram)、(2.039) N-[(1R,4S)-9-(二氯亞甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲橋萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.040) N-[(1S,4R)-9-(二氯亞甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲橋萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.041) N-[1-(2,4-二氯苯基)-1-甲氧基丙-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.042) N-[2-氯-6-(三氟甲基)苯基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡啶-4-甲醯胺、(2.043) N-[3-氯-2-氟-6-(三氟甲基)苯基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-

1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.044) N-[5-氯-2-(三氟甲基)苯甲基]-N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.045) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-N-[5-甲基-2-(三氟甲基)苯甲基]-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.046) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-氟-6-異丙基苯甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.047) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基-5-甲基苯甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.048) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基苯甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲硫代醯胺、(2.049) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(2-異丙基苯甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.050) N-環丙基-3-(二氟甲基)-5-氟-N-(5-氟-2-異丙基苯甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.051) N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-4,5-二甲基苯甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.052) N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-氟苯甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.053) N-環丙基-3-(二氟甲基)-N-(2-乙基-5-甲基苯甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.054) N-環丙基-N-(2-環丙基-5-氟苯甲基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.055) N-環丙基-N-(2-環丙基-5-甲基苯甲基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.056) N-環丙基-N-(2-環丙基苯甲基)-3-(二氟甲基)-5-氟-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.057) 吡唑丙菌胺(pyrapropoyne)。

3)錯合物III處之呼吸鏈之抑制劑，例如：(3.001)辛唑嘧菌胺(ametoctradin)、(3.002)吡啶嘧菌胺(amisulbrom)、(3.003)亞托敏(azoxystrobin)、(3.004)甲香菌酯(coumethoxystrobin)、(3.005)丁香菌酯(coumoxystrobin)、(3.006)賽座滅(cyazofamid)、(3.007)醚菌胺(dimoxystrobin)、(3.008)亞烷基嘧菌酯(enoxastrobin)、(3.009)凡殺同

(famoxadone)、(3.010)咪唑菌酮(fenamidone)、(3.011)氟菌蟎酯(flufenoxystrobin)、(3.012)氟嘧菌酯(fluoxastrobin)、(3.013)克收欣(kresoxim-methyl)、(3.014)苯氧菌胺(metominostrobin)、(3.015)肟醚菌胺(orysastrobin)、(3.016)啉氧菌酯(picoxystrobin)、(3.017)百克敏(pyraclostrobin)、(3.018)唑胺菌酯(pyrametostrobin)、(3.019)唑菌酯(pyraoxystrobin)、(3.020)三氟敏(trifloxystrobin)、(3.021) (2E)-2-{2-[[[(1E)-1-(3-{[(E)-1-氟-2-苯基乙烯基]氧基}苯基)亞乙基]胺基]氧基]甲基]苯基}-2-(甲氧亞胺基)-N-甲基乙醯胺、(3.022) (2E,3Z)-5-{[1-(4-氯苯基)-1H-吡啶-3-基]氧基-2-(甲氧亞胺基)-N,3-二甲基戊-3-烯醯胺、(3.023) (2R)-2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙醯胺、(3.024) (2S)-2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙醯胺、(3.025) 2-甲基丙酸(3S,6S,7R,8R)-8-苯甲基-3-[(3-{[(異丁醯氧基)甲氧基]-4-甲氧基吡啶-2-基}羰基)胺基]-6-甲基-4,9-二側氧基-1,5-二氧雜環壬-7-基酯、(3.026)曼德菌酯(mandestrobin)、(3.027) N-(3-乙基-3,5,5-三甲基環己基)-3-甲醯胺基-2-羥基苯甲醯胺、(3.028) (2E,3Z)-5-{[1-(4-氯-2-氟苯基)-1H-吡啶-3-基]氧基-2-(甲氧亞胺基)-N,3-二甲基戊-3-烯醯胺、(3.029) {5-[3-(2,4-二甲基苯基)-1H-吡啶-1-基]-2-甲基苯甲基}胺基甲酸甲酯、(3.030)苯基吡啶菌酯(metyltetraprole)、(3.031)扶啉氧菌胺(florylpicoxamid)。

4)有絲分裂及細胞分裂之抑制劑，例如(4.001)多菌靈(carbendazim)、(4.002)乙黴威(diethofencarb)、(4.003)噻唑菌胺(ethaboxam)、(4.004)氟吡菌胺(fluopicolide)、(4.005)賓克隆(pencycuron)、(4.006)噻苯達唑(thiabendazole)、(4.007)甲基托布津

(thiophanate-methyl)、(4.008)座賽胺(zoxamide)、(4.009) 3-氯-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基-5-苯基噻嗪、(4.010) 3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基噻嗪、(4.011) 3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)噻嗪、(4.012) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.013) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.014) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-溴苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.015) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.016) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.017) 4-(2-溴-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.018) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.019) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.020) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.021) 4-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.022) 4-(4-氯苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3,6-二甲基噻嗪、(4.023) N-(2-溴-6-氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.024) N-(2-溴苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺、(4.025) N-(4-氯-2,6-二氟苯基)-4-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-胺。

5)具有多位點作用之化合物，例如(5.001)紫紅混合物(bordeaux mixture)、(5.002)四氯丹(captafol)、(5.003)蓋普丹(captan)、(5.004)四氯異苯腈、(5.005)氫氧化銅、(5.006)環烷酸銅、(5.007)氧化銅、(5.008)氧氯化銅、(5.009)硫酸銅(2+)、(5.010)腈硫醯(dithianon)、(5.011)多寧(dodine)、(5.012)滅菌丹(folpet)、(5.013)鋅錳乃浦(mancozeb)、(5.014)錳乃浦(maneb)、(5.015)免得爛(metiram)、(5.016)免得爛鋅、(5.017)罌

辛-銅(oxine-copper)、(5.018)甲基鋅乃浦(propineb)、(5.019)包括聚硫化鈣之硫及硫製劑、(5.020)得恩地(thiram)、(5.021)鋅乃浦(zineb)、(5.022)益穗(ziram)、(5.023) 6-乙基-5,7-二側氧基-6,7-二氫-5H-吡咯并[3',4':5,6][1,4]二噻吡并[2,3-c][1,2]噻唑-3-甲腈。

6)誘導宿主防禦之化合物，例如：(6.001)活化酯-S-甲基、(6.002)異噻菌胺(isotianil)、(6.003)撲殺熱(probenazole)、(6.004)汰敵寧(tiadinil)。

7)胺基酸及/或蛋白質生物合成之抑制劑，例如：(7.001)噻菌環胺(cyprodinil)、(7.002)春日黴素(kasugamycin)、(7.003)水合春日黴素鹽酸鹽、(7.004)土黴素(oxytetracycline)、(7.005)噻黴胺(pyrimethanil)、(7.006) 3-(5-氟-3,3,4,4-四甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉。

8)ATP產生之抑制劑，例如(8.001)矽硫芬(silthiofam)。

9)細胞壁合成之抑制劑，例如：(9.001)苯噻菌胺(benthiavalicarb)、(9.002)達滅芬(dimethomorph)、(9.003)氟嗎啉(flumorph)、(9.004)巚黴威(iprovalicarb)、(9.005)雙炔醯菌胺(mandipropamid)、(9.006)丁吡嗎啉(pyrimorph)、(9.007)威利芬那雷特(valifenalate)、(9.008) (2E)-3-(4-第三丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(嗎啉-4-基)丙-2-烯-1-酮、(9.009) (2Z)-3-(4-第三丁基苯基)-3-(2-氯吡啶-4-基)-1-(嗎啉-4-基)丙-2-烯-1-酮。

10)脂質及膜合成之抑制劑，例如：(10.001)霜黴威(propamocarb)、(10.002)霜黴威鹽酸鹽、(10.003)甲基脫克松(tolclofos-methyl)。

11)黑色素生物合成之抑制劑，例如：(11.001)三賽唑(tricyclazole)、(11.002) {3-甲基-1-[(4-甲基苯甲醯基)胺基]丁-2-基}胺基甲酸2,2,2-三氟乙酯。

12)核酸合成之抑制劑，例如：(12.001)本達樂(benalaxyl)、(12.002)本達樂-M (精苯霜靈(kiralaxyl))、(12.003)滅達樂(metalaxyl)、(12.004)滅達樂-M (右滅達樂(mefenoxam))。

13)信號轉導之抑制劑，例如：(13.001)護汰寧(fludioxonil)、(13.002)依普同(iprodione)、(13.003)撲滅寧(procymidone)、(13.004)丙氧喹啉(proquinazid)、(13.005)快諾芬(quinoxifen)、(13.006)免克寧(vinclozolin)。

14)充當去偶合劑之化合物，例如：(14.001)扶吉胺(fluzinam)、(14.002)敵蟎普(meptyldinocap)。

15)其他化合物，例如(15.001)脫落酸(abscisic acid)、(15.002)苯噻硫氰(benthiazole)、(15.003)吡托沙嗪(bethoxazin)、(15.004)卡巴西黴素(capsimycin)、(15.005)香 芹 酮(carvone)、(15.006)蟎 離 丹(chinomethionat)、(15.007)硫 雜 靈(cufraneb)、(15.008)環 氟 菌 胺(cyflufenamid)、(15.009)克 絕(cymoxanil)、(15.010)環 丙 磺 醯 胺(cyprosulfamide)、(15.011)氟替尼(flutianil)、(15.012)福賽得鋁(fosetyl-aluminium)、(15.013)福賽得鈣(fosetyl-calcium)、(15.014)福賽得鈉(fosetyl-sodium)、(15.015)異 硫 氰 酸 甲 酯、(15.016)滅 芬 農(metrafenone)、(15.017)米 多 黴 素(mildiomycin)、(15.018)遊 黴 素(natamycin)、(15.019)二 甲 基 二 硫 代 胺 基 甲 酸 鎳(nickel dimethyldithiocarbamate)、(15.020)滅鏽胺異丙酯(nitrothal-isopropyl)、(15.021)奧 克 斯 莫 卡 賓(oxamocarb)、(15.022)奧 賽 普 林(oxathiapiprolin)、(15.023)奧克斯芬塞林(oxyfenthiiin)、(15.024)五氯苯酚及鹽、(15.025)亞磷酸及其鹽、(15.026)乙膦酸霜黴威(propamocarb-

fosetylate)、(15.027)甲氧苯噁菌(pyriofenone) (氯芬酮(chlazafenone))、
 (15.028)特 普 弗 洛 奎(tebufloquin)、(15.029)克 枯 爛(tecloftalam)、
 (15.030)甲 磺 菌 胺(tolnifanide)、(15.031) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二 氟 苯
 基)-4,5-二 氫-1,2-噁 唑-3-基]-1,3-噻 唑-2-基} 哌 啶-1-基)-2-[5-甲 基-3-(三 氟
 甲 基)-1H-吡 唑-1-基]乙 酮、(15.032) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二 氟 苯 基)-4,5-
 二 氫-1,2-噁 唑-3-基]-1,3-噻 唑-2-基} 哌 啶-1-基)-2-[5-甲 基-3-(三 氟 甲 基)-
 1H-吡 唑-1-基]乙 酮、(15.033) 2-(6-苯 甲 基 吡 啶-2-基)喹 唑 啉、(15.034)
 二 吡 甲 噻 酮(dipymetitrone)、(15.035) 2-[3,5-雙(二 氟 甲 基)-1H-吡 唑-1-
 基]-1-[4-(4-{5-[2-(丙-2-炔-1-基 氧 基) 苯 基]-4,5-二 氫-1,2-噁 唑-3-基}-1,3-
 噻 唑-2-基) 哌 啶-1-基]乙 酮、(15.036) 2-[3,5-雙(二 氟 甲 基)-1H-吡 唑-1-
 基]-1-[4-(4-{5-[2-氯-6-(丙-2-炔-1-基 氧 基) 苯 基]-4,5-二 氫-1,2-噁 唑-3-
 基}-1,3-噻 唑-2-基) 哌 啶-1-基]乙 酮、(15.037) 2-[3,5-雙(二 氟 甲 基)-1H-吡
 唑-1-基]-1-[4-(4-{5-[2-氟-6-(丙-2-炔-1-基 氧 基) 苯 基]-4,5-二 氫-1,2-噁 唑-
 3-基}-1,3-噻 唑-2-基) 哌 啶-1-基]乙 酮、(15.038) 2-[6-(3-氟-4-甲 氧 基 苯
 基)-5-甲 基 吡 啶-2-基]喹 唑 啉、(15.039)甲 磺 酸 2-[(5R)-3-[2-(1-{[3,5-雙
 (二 氟 甲 基)-1H-吡 唑-1-基]乙 醯 基} 哌 啶-4-基)-1,3-噻 唑-4-基]-4,5-二 氫-
 1,2-噁 唑-5-基]-3-氯 苯 酯、(15.040)甲 磺 酸 2-[(5S)-3-[2-(1-{[3,5-雙(二 氟
 甲 基)-1H-吡 唑-1-基]乙 醯 基} 哌 啶-4-基)-1,3-噻 唑-4-基]-4,5-二 氫-1,2-噁
 唑-5-基]-3-氯 苯 酯、(15.041)依 普 氟 芬 喹(Ipflufenquin)、(15.042) 2-{2-
 氟-6-[(8-氟-2-甲 基 喹 啉-3-基) 氧 基] 苯 基} 丙-2-醇、(15.043)甲 磺 酸 2-{3-
 [2-(1-{[3,5-雙(二 氟 甲 基)-1H-吡 唑-1-基]乙 醯 基} 哌 啶-4-基)-1,3-噻 唑-4-
 基]-4,5-二 氫-1,2-噁 唑-5-基]-3-氯 苯 酯、(15.044)甲 磺 酸 2-{3-[2-(1-{[3,5-
 雙(二 氟 甲 基)-1H-吡 唑-1-基]乙 醯 基} 哌 啶-4-基)-1,3-噻 唑-4-基]-4,5-二 氫-

1,2-噁唑-5-基}苯酯、(15.045) 2-苯基苯酚及鹽、(15.046) 3-(4,4,5-三氟-3,3-二甲基-3,4-二氫異喹啉-1-基)喹啉、(15.047)喹富滅靈(quinofumelin)、(15.048) 4-胺基-5-氟嘧啶-2-醇(互變異構形式：4-胺基-5-氟嘧啶-2(1H)-酮)、(15.049) 4-側氧基-4-[(2-苯乙基)胺基]丁酸、(15.050) 5-胺基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(15.051) 5-氯-N'-苯基-N'-(丙-2-炔-1-基)噻吩-2-苯磺醯肼、(15.052) 5-氟-2-[(4-氟苯甲基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.053) 5-氟-2-[(4-甲基苯甲基)氧基]嘧啶-4-胺、(15.054) 9-氟-2,2-二甲基-5-(喹啉-3-基)-2,3-二氫-1,4-苯并噁氮呼、(15.055) {6-[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亞甲基]胺基}氧基)甲基]吡啶-2-基}胺基甲酸丁-3-炔-1-基酯、(15.056) (2Z)-3-胺基-2-氰基-3-苯基丙烯酸乙酯、(15.057) 吩嗪-1-甲酸、(15.058) 3,4,5-三羥基苯甲酸丙酯、(15.059)喹啉-8-醇、(15.060)喹啉-8-醇硫酸酯(2:1)、(15.061) {6-[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苯基)亞甲基]胺基}氧基)甲基]吡啶-2-基}胺基甲酸第三丁酯、(15.062) 5-氟-4-亞胺基-3-甲基-1-[(4-甲基苯基)磺醯基]-3,4-二氫嘧啶-2(1H)-酮、(15.063)胺基吡芬(aminopyrifen)。

【0121】如本文上文所描述之類別(1)至(15)之所有提及之混合搭配物均可以游離化合物形式及/或(若其官能基致能此)其農業上可接受之鹽形式存在。

【0122】在一些實施例中，化合物組合包含以下組分：

(I.01) + (1.001)、(I.01) + (1.002)、(I.01) + (1.003)、(I.01) + (1.004)、(I.01) + (1.005)、(I.01) + (1.006)、(I.01) + (1.007)、(I.01) + (1.008)、(I.01) + (1.009)、(I.01) + (1.010)、(I.01) + (1.011)、(I.01) + (1.012)、(I.01) + (1.013)、(I.01) + (1.014)、(I.01) + (1.015)、(I.01) +

(1.016)、(I.01) + (1.017)、(I.01) + (1.018)、(I.01) + (1.019)、(I.01) +
(1.020)、(I.01) + (1.021)、(I.01) + (1.022)、(I.01) + (1.023)、(I.01) +
(1.024)、(I.01) + (1.025)、(I.01) + (1.026)、(I.01) + (1.027)、(I.01) +
(1.028)、(I.01) + (1.029)、(I.01) + (1.030)、(I.01) + (1.031)、(I.01) +
(1.032)、(I.01) + (1.033)、(I.01) + (1.034)、(I.01) + (1.035)、(I.01) +
(1.036)、(I.01) + (1.037)、(I.01) + (1.038)、(I.01) + (1.039)、(I.01) +
(1.040)、(I.01) + (1.041)、(I.01) + (1.042)、(I.01) + (1.043)、(I.01) +
(1.044)、(I.01) + (1.045)、(I.01) + (1.046)、(I.01) + (1.047)、(I.01) +
(1.048)、(I.01) + (1.049)、(I.01) + (1.050)、(I.01) + (1.051)、(I.01) +
(1.052)、(I.01) + (1.053)、(I.01) + (1.054)、(I.01) + (1.055)、(I.01) +
(1.056)、(I.01) + (1.057)、(I.01) + (1.058)、(I.01) + (1.059)、(I.01) +
(1.060)、(I.01) + (1.061)、(I.01) + (1.062)、(I.01) + (1.063)、(I.01) +
(1.064)、(I.01) + (1.065)、(I.01) + (1.066)、(I.01) + (1.067)、(I.01) +
(1.068)、(I.01) + (1.069)、(I.01) + (1.070)、(I.01) + (1.071)、(I.01) +
(1.072)、(I.01) + (1.073)、(I.01) + (1.074)、(I.01) + (1.075)、(I.01) +
(1.076)、(I.01) + (1.077)、(I.01) + (1.078)、(I.01) + (1.079)、(I.01) +
(1.080)、(I.01) + (1.081)、(I.01) + (1.082)、(I.01) + (1.083)、(I.01) +
(1.084)、(I.01) + (1.085)、(I.01) + (1.086)、(I.01) + (2.001)、(I.01) +
(2.002)、(I.01) + (2.003)、(I.01) + (2.004)、(I.01) + (2.005)、(I.01) +
(2.006)、(I.01) + (2.007)、(I.01) + (2.008)、(I.01) + (2.009)、(I.01) +
(2.010)、(I.01) + (2.011)、(I.01) + (2.012)、(I.01) + (2.013)、(I.01) +
(2.014)、(I.01) + (2.015)、(I.01) + (2.016)、(I.01) + (2.017)、(I.01) +
(2.018)、(I.01) + (2.019)、(I.01) + (2.020)、(I.01) + (2.021)、(I.01) +

(2.022)、(I.01) + (2.023)、(I.01) + (2.024)、(I.01) + (2.025)、(I.01) +
(2.026)、(I.01) + (2.027)、(I.01) + (2.028)、(I.01) + (2.029)、(I.01) +
(2.030)、(I.01) + (2.031)、(I.01) + (2.032)、(I.01) + (2.033)、(I.01) +
(2.034)、(I.01) + (2.035)、(I.01) + (2.036)、(I.01) + (2.037)、(I.01) +
(2.038)、(I.01) + (2.039)、(I.01) + (2.040)、(I.01) + (2.041)、(I.01) +
(2.042)、(I.01) + (2.043)、(I.01) + (2.044)、(I.01) + (2.045)、(I.01) +
(2.046)、(I.01) + (2.047)、(I.01) + (2.048)、(I.01) + (2.049)、(I.01) +
(2.050)、(I.01) + (2.051)、(I.01) + (2.052)、(I.01) + (2.053)、(I.01) +
(2.054)、(I.01) + (2.055)、(I.01) + (2.056)、(I.01) + (3.001)、(I.01) +
(3.002)、(I.01) + (3.003)、(I.01) + (3.004)、(I.01) + (3.005)、(I.01) +
(3.006)、(I.01) + (3.007)、(I.01) + (3.008)、(I.01) + (3.009)、(I.01) +
(3.010)、(I.01) + (3.011)、(I.01) + (3.012)、(I.01) + (3.013)、(I.01) +
(3.014)、(I.01) + (3.015)、(I.01) + (3.016)、(I.01) + (3.017)、(I.01) +
(3.018)、(I.01) + (3.019)、(I.01) + (3.020)、(I.01) + (3.021)、(I.01) +
(3.022)、(I.01) + (3.023)、(I.01) + (3.024)、(I.01) + (3.025)、(I.01) +
(3.026)、(I.01) + (3.027)、(I.01) + (3.028)、(I.01) + (3.029)、(I.01) +
(3.030)、(I.01) + (4.001)、(I.01) + (4.002)、(I.01) + (4.003)、(I.01) +
(4.004)、(I.01) + (4.005)、(I.01) + (4.006)、(I.01) + (4.007)、(I.01) +
(4.008)、(I.01) + (4.009)、(I.01) + (4.010)、(I.01) + (4.011)、(I.01) +
(4.012)、(I.01) + (4.013)、(I.01) + (4.014)、(I.01) + (4.015)、(I.01) +
(4.016)、(I.01) + (4.017)、(I.01) + (4.018)、(I.01) + (4.019)、(I.01) +
(4.020)、(I.01) + (4.021)、(I.01) + (4.022)、(I.01) + (4.023)、(I.01) +
(4.024)、(I.01) + (4.025)、(I.01) + (5.001)、(I.01) + (5.002)、(I.01) +

(5.003)、(I.01) + (5.004)、(I.01) + (5.005)、(I.01) + (5.006)、(I.01) +
(5.007)、(I.01) + (5.008)、(I.01) + (5.009)、(I.01) + (5.010)、(I.01) +
(5.011)、(I.01) + (5.012)、(I.01) + (5.013)、(I.01) + (5.014)、(I.01) +
(5.015)、(I.01) + (5.016)、(I.01) + (5.017)、(I.01) + (5.018)、(I.01) +
(5.019)、(I.01) + (5.020)、(I.01) + (5.021)、(I.01) + (5.022)、(I.01) +
(5.023)、(I.01) + (6.001)、(I.01) + (6.002)、(I.01) + (6.003)、(I.01) +
(6.004)、(I.01) + (7.001)、(I.01) + (7.002)、(I.01) + (7.003)、(I.01) +
(7.004)、(I.01) + (7.005)、(I.01) + (7.006)、(I.01) + (8.001)、(I.01) +
(9.001)、(I.01) + (9.002)、(I.01) + (9.003)、(I.01) + (9.004)、(I.01) +
(9.005)、(I.01) + (9.006)、(I.01) + (9.007)、(I.01) + (9.008)、(I.01) +
(9.009)、(I.01) + (10.001)、(I.01) + (10.002)、(I.01) + (10.003)、(I.01)
+ (11.001)、(I.01) + (11.002)、(I.01) + (12.001)、(I.01) + (12.002)、
(I.01) + (12.003)、(I.01) + (12.004)、(I.01) + (13.001)、(I.01) +
(13.002)、(I.01) + (13.003)、(I.01) + (13.004)、(I.01) + (13.005)、
(I.01) + (13.006)、(I.01) + (14.001)、(I.01) + (14.002)、(I.01) +
(15.001)、(I.01) + (15.002)、(I.01) + (15.003)、(I.01) + (15.004)、
(I.01) + (15.005)、(I.01) + (15.006)、(I.01) + (15.007)、(I.01) +
(15.008)、(I.01) + (15.009)、(I.01) + (15.010)、(I.01) + (15.011)、
(I.01) + (15.012)、(I.01) + (15.013)、(I.01) + (15.014)、(I.01) +
(15.015)、(I.01) + (15.016)、(I.01) + (15.017)、(I.01) + (15.018)、
(I.01) + (15.019)、(I.01) + (15.020)、(I.01) + (15.021)、(I.01) +
(15.022)、(I.01) + (15.023)、(I.01) + (15.024)、(I.01) + (15.025)、
(I.01) + (15.026)、(I.01) + (15.027)、(I.01) + (15.028)、(I.01) +

(15.029)、(I.01) + (15.030)、(I.01) + (15.031)、(I.01) + (15.032)、
 (I.01) + (15.033)、(I.01) + (15.034)、(I.01) + (15.035)、(I.01) +
 (15.036)、(I.01) + (15.037)、(I.01) + (15.038)、(I.01) + (15.039)、
 (I.01) + (15.040)、(I.01) + (15.041)、(I.01) + (15.042)、(I.01) +
 (15.043)、(I.01) + (15.044)、(I.01) + (15.045)、(I.01) + (15.046)、
 (I.01) + (15.047)、(I.01) + (15.048)、(I.01) + (15.049)、(I.01) +
 (15.050)、(I.01) + (15.051)、(I.01) + (15.052)、(I.01) + (15.053)、
 (I.01) + (15.054)、(I.01) + (15.055)、(I.01) + (15.056)、(I.01) +
 (15.057)、(I.01) + (15.058)、(I.01) + (15.059)、(I.01) + (15.060)、
 (I.01) + (15.061)、(I.01) + (15.062)、(I.01) + (15.063)、(I.01) +
 (15.064)、(I.01) + (15.065)、(I.01) + 15.066)、(I.01) + (15.067)、
 (I.01) + (15.068)、(I.01) + (15.069)、(I.01) + (15.070)、(I.01) +
 (15.071)、(I.01) + (15.072)、(I.01) + (15.073)、(I.01) + (15.074)、
 (I.01) + (15.075)、(I.01) + (15.076)、(I.01)、(I.01) + (15.077)、(I.01)
 + (15.078)、(I.01) + (15.079)、(I.01) + (15. 080)、(I.01) + (15.081)、
 (I.01) + (15.082)、(I.01) + (15.083)、(I.01) + (15.084)、(I.01) +
 (15.085)、(I.01) + (15.086)、(I.01) + (15.087)、(I.01) + (15.088)、
 (I.01) + (15.089)、(I.01) + (15.090)、(I.01) + (15.091)、(I.01) +
 (15.092)、(I.01) + (15.093)、(I.01) + (15.094)、(I.01) + (15.095)、
 (I.01) + (15.096)、(I.01) + (15.097)、(I.01) + (15.098)、(I.01) +
 (15.099)、(I.01) + (15.100)、(I.01) + (15.101)、(I.01) + (15.102)、
 (I.01) + (15.103)、(I.01) + (15.104)、(I.01) + (15.105)、(I.01) +
 (15.106)、(I.01) + (15.107)、(I.01) + (15.108)、(I.01) + (15.109)、

(I.01) + (15.110)、(I.01) + (15.111)、(I.01) + (15.112)。

【0123】 在此等組合中，第一成分為如表I.1 (例如，I.01)中所定義之式(I)化合物且第二成分為如本文中所定義之群組1至15中所選擇的殺真菌劑。舉例而言，組合(I.01)+(1.001)對應於包含表I.1中之化合物I.01及環克座(1.001)之組合。

【0124】 在一些其他實施例中，化合物組合對應於上文所描述之組合，其中化合物(I.01)經表I.1中所敘述之化合物中之任一者置換。

【0125】 式(I)化合物及選自群組(1)至(15)之殺真菌劑可以範圍介於100:1至1:100 (式(I)化合物：選自群組(1)至(15)之殺真菌劑)或範圍介於50:1至1:50或範圍介於20:1至1:20之重量比存在。重量比範圍之其他實例包括95:1至1:95、90:1至1:90、85:1至1:85、80:1至1:80、75:1至1:75、70:1至1:70、65:1至1:65、60:1至1:60、55:1至1:55、45:1至1:45、40:1至1:40、35:1至1:35、30:1至1:30、25:1至1:25、15:1至1:15、10:1至1:10、5:1至1:5、4:1至1:4、3:1至1:3、2:1至1:2。

【0126】 如本文中所定義之群組1至15中所選擇的其他殺真菌劑可添加至化合物組合。

【0127】 本發明之化合物及組合物亦可與一或多種生物控制劑組合。

【0128】 可與本發明之化合物及組合物組合的生物控制劑之實例為：

(A)選自由以下組成之群的抗細菌劑：

(A1)細菌，諸如(A1.1)枯草桿菌(*Bacillus subtilis*)，尤其菌株QST713/AQ713 (可作為SERENADE OPTI或SERENADE ASO自美國

Bayer CropScience LP獲得，具有NRRL寄存編號B21661且描述於美國專利第6,060,051號中)；(A1.2)解澱粉芽孢桿菌(*Bacillus amyloliquefaciens*)，尤其菌株D747 (可作為Double Nickel™自美國Certis獲得，具有寄存編號FERM BP-8234且揭示於美國專利第7,094,592號中)；(A1.3)短小芽孢桿菌(*Bacillus pumilus*)，尤其菌株BU F-33 (具有NRRL寄存編號50185)；(A1.4)枯草桿菌變種解澱粉芽孢桿菌(*Bacillus subtilis var. amyloliquefaciens*)菌株FZB24 (可作為Taegro®自美國Novozymes獲得)；(A1.5)類芽孢桿菌屬(*Paenibacillus sp.*)菌株，其具有寄存編號NRRL B-50972或寄存編號NRRL B-67129且描述於國際專利公開案第WO 2016/154297號中；及

(A2)真菌，諸如(A2.1)出芽短梗黴菌(*Aureobasidium pullulans*)，尤其菌株DSM14940之芽生孢子；(A2.2)菌株DSM 14941之出芽短梗黴菌芽生孢子；(A2.3)出芽短梗黴菌，尤其菌株DSM14940及DSM14941之芽生孢子的混合物；

(B)選自由以下組成之群的殺真菌劑：

(B1)細菌，例如(B1.1)枯草桿菌，尤其菌株QST713/AQ713 (可作為SERENADE OPTI或SERENADE ASO自美國Bayer CropScience LP獲得，具有NRRL寄存編號B21661且描述於美國專利第6,060,051號中)；(B1.2)短小芽孢桿菌，尤其菌株QST2808 (可作為SONATA®自美國Bayer CropScience LP獲得，具有寄存編號NRRL B-30087且描述於美國專利第6,245,551號中)；(B1.3)短小芽孢桿菌，尤其菌株GB34 (可作為Yield Shield®自德國Bayer AG獲得)；(B1.4)短小芽孢桿菌，尤其菌株BU F-33 (具有NRRL寄存編號50185)；(B1.5)解澱粉芽孢桿菌，尤其菌株D747 (可

作為Double Nickel™自美國Certis獲得，其具有寄存編號FERM BP-8234且揭示於美國專利第7,094,592號中)；(B1.6)枯草桿菌Y1336 (可作為BIOBAC® WP自臺灣Bion-Tech獲得，其在臺灣以註冊號4764、5454、5096及5277註冊為生物殺真菌劑)；(B1.7)解澱粉芽孢桿菌菌株MBI 600 (可作為SUBTILEX自BASF SE獲得)；(B1.8)枯草桿菌菌株GB03 (可作為Kodiak®自德國Bayer AG獲得)；(B1.9)枯草桿菌變種解澱粉芽孢桿菌菌株FZB24 (可作為殺真菌劑TAEGRO®或TAEGRO® ECO (EPA註冊號70127-5)自Novozymes Biologicals Inc., Salem, Virginia或Syngenta Crop Protection, LLC, Greensboro, North Carolina獲得)；(B1.10)蕈狀桿菌(*Bacillus mycoides*)，分離物J (可作為BmJ TGAi或WG自美國Certis獲得)；(B1.11)地衣芽孢桿菌(*Bacillus licheniformis*)，尤其菌株SB3086 (可作為EcoGuard™ Biofungicide及Green Releaf自Novozymes獲得)；(B1.12)類芽孢桿菌屬菌株，其具有寄存編號NRRL B-50972或寄存編號NRRL B-67129且描述於國際專利公開案第WO 2016/154297號中。

【0129】 在一些實施例中，生物控制劑為產生豐原素(fengycin)或大側柏素(plipastatin)類型化合物、伊枯草菌素(iturin)類型化合物及/或表面活性素類型化合物的枯草桿菌或解澱粉芽孢桿菌菌株。對於先前技術，參見以下評論文章：Ongena, M.等人，「*Bacillus* Lipopeptides: Versatile Weapons for Plant Disease Biocontrol」, Trends in Microbiology, 第16卷, 第3期, 2008年3月, 第115-125頁。能夠產生脂肽之芽孢桿菌菌株包括：枯草桿菌QST713 (可作為SERENADE OPTI或SERENADE ASO自美國Bayer CropScience LP獲得，其具有NRRL寄存編號B21661且描述於美國專利第6,060,051號中)；解澱粉芽孢桿菌菌株D747 (可作為Double

Nickel™自美國Certis獲得，其具有寄存編號FERM BP-8234且揭示於美國專利第7,094,592號中)；枯草桿菌MBI600 (可作為SUBTILEX®自Becker Underwood獲得，US EPA註冊號71840-8)；枯草桿菌Y1336 (可作為BIOBAC® WP自臺灣Bion-Tech獲得，其在臺灣以註冊號4764、5454、5096及5277註冊為生物殺真菌劑)；解澱粉芽孢桿菌，尤其菌株FZB42 (可作為RHIZOVITAL®自德國ABiTEP獲得)；及枯草桿菌變種解澱粉芽孢桿菌FZB24 (可作為殺真菌劑TAEGRO®或TAEGRO® ECO (EPA註冊號70127-5)自Novozymes Biologicals Inc., Salem, Virginia或Syngenta Crop Protection, LLC, Greensboro, North Carolina獲得)；及

(B2)真菌，例如：(B2.1)盾殼黴(*Coniothyrium minitans*)，尤其菌株CON/M/91-8 (寄存編號DSM-9660；例如來自Bayer之Contans®)；(B2.2)核果梅奇酵母(*Metschnikowia fructicola*)，尤其菌株NRRL Y-30752 (例如，Shemer®)；(B2.3)赫色小球殼孢菌(*Microsphaeropsis ochracea*)，(例如，來自Propytha之Microx®)；(B2.5)木黴菌屬(*Trichoderma spp.*)，包括描述於國際申請案第PCT/IT2008/000196號中之深綠木黴菌(*Trichoderma atroviride*)，菌株SC1；(B2.6)哈茨木黴菌(*Trichoderma harzianum rifai*)菌株KRL-AG2 (亦稱為菌株T-22/ATCC 208479，例如來自美國BioWorks之PLANTSHIELD T-22G、Rootshield®及TurfShield)；(B2.14)粉紅膠黴菌(*Gliocladium roseum*)，來自W.F.Stoneman Company LLC之菌株321U；(B2.35)黃色籃狀菌(*Talaromyces flavus*)，菌株V117b；(B2.36)棘孢木黴(*Trichoderma asperellum*)，來自Isagro之菌株ICC 012；(B2.37)棘孢木黴，菌株SKT-1 (例如，來自Kumiai Chemical Industry之ECO-HOPE®)；(B2.38)深綠木

黴菌，菌株CNCM I-1237 (例如，來自Agrauxine, FR之Esquive® WP)；
 (B2.39)深綠木黴菌，菌株第V08/002387號；(B2.40)深綠木黴菌，菌株
 NMI第V08/002388號；(B2.41)深綠木黴菌，菌株NMI第V08/002389號；
 (B2.42)深綠木黴菌，菌株NMI第V08/002390號；(B2.43)深綠木黴菌，菌
 株LC52 (例如，由Agrimm Technologies Limited產生之Tenet)；(B2.44)
 深綠木黴菌，菌株ATCC 20476 (IMI 206040)；(B2.45)深綠木黴菌，菌
 株T11 (IMI352941/CECT20498)；(B2.46)鉤狀木黴(*Trichoderma*
harmatum)；(B2.47)哈茨木黴(*Trichoderma harzianum*)；(B2.48)哈茨木
 黴菌T39 (例如，來自美國Makhteshim之Trichodex®)；(B2.49)哈茨木
 黴，尤其菌株KD (例如，來自Biological Control Products之Trichoplus、
 SA (由Becker Underwood獲得))；(B2.50)哈茨木黴，菌株ITEM 908 (例
 如，來自Koppert之Trianum-P)；(B2.51)哈茨木黴，菌株TH35 (例如，
 Mycontrol之Root-Pro)；(B2.52)綠木黴(*Trichoderma virens*) (亦稱為綠
 黏帚黴(*Gliocladium virens*))，尤其菌株GL-21 (例如，美國Certis之
 SoilGard 12G)；(B2.53)綠色木黴(*Trichoderma viride*)，菌株TV1 (例
 如，Koppert之Trianum-P)；(B2.54)白粉寄生孢(*Ampelomyces*
quisqualis)，尤其菌株AQ 10 (例如，意大利IntrachemBio之AQ 10®)；
 (B2.56)出芽短梗黴菌，尤其菌株DSM14940之芽生孢子；(B2.57)出芽短
 梗黴菌，尤其菌株DSM 14941之芽生孢子；(B2.58)出芽短梗黴菌，尤其
 菌株DSM14940及DSM 14941之芽生孢子的混合物(例如，bio-ferm, CH
 之Botector®)；(B2.64)枝孢芽枝菌(*Cladosporium cladosporioides*)，菌
 株H39 (Stichting Dienst Landbouwkundig Onderzoek)；(B2.69)鏈抱黏帚
 菌(*Gliocladium catenulatum*) (同義詞：鏈狀粉紅黏帚黴(*Clonostachys*

rosea f. catenulate)菌株J1446 (例如, AgBio Inc.之Prestop®以及例如 Kemira Agro Oy之Primastop®); (B2.70)菌 株KV01 (例 如, Koppert/Arysta之Vertalec®)之臘蚧輪刺孢菌(*Lecanicillium lecanii*) (以前稱為臘蚧輪枝菌(*Verticillium lecanii*))分生孢子; (B2.71)蠕形青黴(*Penicillium vermiculatum*); (B2.72)異常畢赤酵母(*Pichia anomala*), 菌株WRL-076 (NRRL Y-30842); (B2.75)深綠木黴菌, 菌株SKT-1 (FERM P-16510); (B2.76)深綠木黴菌, 菌株SKT-2 (FERM P-16511); (B2.77)深綠木黴菌, 菌株SKT-3 (FERM P-17021); (B2.78)蓋姆斯木黴(*Trichoderma gamsii*) (以前為綠色木黴), 菌株ICC080 (IMI CC 392151 CABI, 例如AGROBIOSOL DE MEXICO, S.A. DE C.V.之BioDerma); (B2.79)哈茨木黴, 菌株DB 103 (例如, Dagutat Biolab之T-Gro 7456); (B2.80)多孢木黴(*Trichoderma polysporum*), 菌株IMI 206039 (例如, 瑞典BINAB Bio-Innovation AB之Binab TF WP); (B2.81)子座木黴(*Trichoderma stromaticum*) (例如, 巴西Ceplac之Tricovab); (B2.83)奧德曼細基格孢(*Ulocladium oudemansii*), 尤其菌株HRU3 (例如, Botry-Zen Ltd, NZ之Botry-Zen®); (B2.84)黑白輪枝菌(*Verticillium albo-atrum*) (以前為大麗輪枝菌(*V. dahliae*)), 菌株WCS850 (CBS 276.92; 例如Tree Care Innovations之Dutch Trig); (B2.86)厚孢輪枝菌(*Verticillium chlamydosporium*); (B2.87)棘孢木黴菌株ICC 012及蓋姆斯木黴菌株ICC 080之混合物(稱為例如來自美國Bayer CropScience LP之BIO-TAM™的產物)。

【0130】 可與本發明之化合物及組合物組合的生物控制劑之其他實例為：

選自由以下組成之群的細菌：蠟狀芽胞桿菌(*Bacillus cereus*)，尤其蠟狀芽胞桿菌(*B. cereus*)菌株CNCM I-1562及強固芽胞桿菌(*Bacillus firmus*)菌株I-1582 (寄存編號CNCM I-1582)；枯草桿菌菌株OST 30002 (寄存編號NRRL B-50421)；蘇力菌(*Bacillus thuringiensis*)，尤其蘇雲金芽胞桿菌以色列亞種(*B. thuringiensis subspecies israelensis*) (血清型H-14)，菌株AM65-52 (寄存編號ATCC 1276)，蘇雲金芽胞桿菌亞莎華亞種(*B. thuringiensis subsp. aizawai*)，尤其菌株ABTS-1857 (SD-1372)，蘇雲金芽胞桿菌庫斯塔克亞種(*B. thuringiensis subsp. kurstaki*)菌株HD-1，蘇雲金芽胞桿菌擬步行甲亞種(*B. thuringiensis subsp. tenebrionis*)菌株NB 176 (SD-5428)；穿刺巴斯德芽菌(*Pasteuria penetrans*)；巴斯德氏菌屬(*Pasteuria spp.*) (腎形腎狀線蟲)-PR3 (寄存編號ATCC SD-5834)；細黃鏈黴菌(*Streptomyces microflavus*)菌株AQ6121 (=QRD 31.013，NRRL B-50550)；及鮮黃鏈黴菌菌株AQ 6047 (寄存編號NRRL 30232)；

選自由以下組成之群的真菌及酵母：白殭菌(*Beauveria bassiana*)，尤其菌株ATCC 74040；輪枝菌屬(*Lecanicillium spp.*)，尤其菌株HRO LEC 12；黑殭菌(*Metarhizium anisopliae*)，尤其菌株F52 (DSM3884或ATCC 90448)；玫煙色擬青黴(*Paecilomyces fumosoroseus*；現為玫煙色棒束孢(*Isaria fumosorosea*))，尤其菌株IFPC 200613或菌株Apopka 97 (寄存編號ATCC 20874)；及淡紫擬青黴(*Paecilomyces lilacinus*)，尤其淡紫擬青黴菌株251 (AGAL 89/030550)；

選自由以下組成之群的病毒：茶姬卷葉蛾(*Adoxophyes orana*) (夏季水果卷葉蛾)顆粒體病毒(*granulosis virus*；GV)；蘋果蠹蛾(*Cydia pomonella*) (蘋果卷葉蛾)顆粒體病毒(GV)；番茄夜蛾(*Helicoverpa*

armigera) (棉鈴蟲)核多角體病毒(*nuclear polyhedrosis virus* ; NPV) ; 甜菜葉蛾(*Spodoptera exigua*) (甜菜夜蛾) mNPV ; 草地黏蟲(*Spodoptera frugiperda*) (秋夜蛾) mNPV ; 及灰翅夜蛾(*Spodoptera littoralis*) (非洲棉葉蟲) NPV ;

可作為「接種體」添加至植物或植物部分或植物器官且藉助於其特定特性而促進植物生長及植物健康的細菌及真菌。實例為：農桿菌屬(*Agrobacterium spp.*)、莖瘤固氮根瘤菌(*Azorhizobium caulinodans*)、固氮螺旋菌屬(*Azospirillum spp.*)、固氮菌屬(*Azotobacter spp.*)、慢生根瘤菌屬(*Bradyrhizobium spp.*)、伯克霍爾德菌屬(*Burkholderia spp.*) (尤其洋蔥伯克霍爾德氏菌(*Burkholderia cepacia*) (以前稱為洋蔥假單胞菌(*Pseudomonas cepacia*)))、巨孢囊黴屬(*Gigaspora spp.*)或單孢球囊黴(*Gigaspora monosporum*)、叢枝菌根菌屬(*Glomus spp.*)、蠟蘑菌屬(*Laccaria spp.*)、布氏乳桿菌(*Lactobacillus buchneri*)、類球囊黴屬(*Paraglomus spp.*)、彩色豆馬勃(*Pisolithus tinctorus*)、假單胞菌屬(*Pseudomonas spp.*)、根瘤菌屬(*Rhizobium spp.*) (尤其三葉草根瘤菌)、麥蕈屬(*Rhizopogon spp.*)、硬皮馬勃屬(*Scleroderma spp.*)、兔蕈屬(*Suillus spp.*)及鏈黴菌屬(*Streptomyces spp.*) ;

植物提取物及由包括可用作生物控制劑的蛋白質及次級代謝物的微生物形成的產物，諸如蒜(*Allium sativum*)、中亞苦蒿(*Artemisia absinthium*)、印楝素(*azadirachtin*)、Biokeeper WP、黑決明(*Cassia nigricans*)、苦皮藤(*Celastrus angulatus*)、藜屬土荊芥(*Chenopodium anthelminticum*)、甲殼素、Armour-Zen、歐洲鱗毛蕨(*Dryopteris filix-mas*)、問荊(*Equisetum arvense*)、Fortune Aza、薄荷油(*Fungastop*)、

Heds Up (藜麥(*Chenopodium quinoa*)皂素萃取物)、除蟲菊/除蟲菊精(*Pyrethrum/Pyrethrins*)、蘇林南苦木(*Quassia amara*)、櫟屬(*Quercus*)、皂皮樹屬(*Quillaja*)、Regalia、「Requiem™殺昆蟲劑」、魚藤酮、魚尼丁/理阿諾鹼(*ryania/ryanodine*)、聚合草(*Symphytum officinale*)、菊蒿(*Tanacetum vulgare*)、瑞香草酚、Triact 70、TriCon、旱金蓮(*Tropaeolum majus*)、異株蕁麻(*Urtica dioica*)、藜蘆鹼(Veratrin)、槲寄生(*Viscum album*)、芸苔科(*Brassicaceae*)萃取物，尤其油菜粉或芥末粉。

【0131】可與本發明之化合物及組合物混合的殺蟲劑、殺蟎劑及殺線蟲劑之實例分別為：

(1)乙醯膽鹼酯酶(AChE)抑制劑，諸如胺基甲酸酯類，例如棉靈威(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、惡蟲威(bendiocarb)、免扶克(benfuracarb)、丁酮威(butocarboxim)、丁酮虱威(butoxycarboxim)、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、殺蟲丹(ethiofencarb)、仲丁威(fenobucarb)、複滅蟎(formetanate)、呋線威(furathiocarb)、葉蟬散(isoprocarb)、滅賜克(methiocarb)、納乃得(methomyl)、速滅威(metolcarb)、歐殺滅(oxamyl)、比加普(pirimicarb)、安丹(propoxur)、硫敵克(thiodicarb)、久效威(thiofanox)、啞蚜威(triazamate)、混滅威(trimethacarb)、XMC及滅殺威(xylylcarb)；或有機磷酸酯，例如歐殺松(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)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-

methyl)、蠅毒磷(coumaphos)、殺螟腈(cyanophos)、甲基硫代內吸磷(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)、伐滅磷(famphur)、芬滅松(fenamiphos)、撲滅松(fenitrothion)、芬殺松(fenthion)、噻唑磷(fosthiazate)、庚烯磷(heptenophos)、新菸磷(imicyafos)、異柳磷(isofenphos)、水楊酸異丙酯O-(甲氧基胺基硫基-磷醯酯)、加福松(isoxathion)、馬拉硫磷(malathion)、滅蚜磷(mecarbam)、達馬松(methamidophos)、滅大松(methidathion)、美文松(mevinphos)、亞素靈(monocrotophos)、二溴磷(naled)、氧樂果(omethoate)、甲基滅多松(oxydemeton-methyl)、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)、巴賽松(phoxim)、甲基亞特松(pirimiphos-methyl)、布飛松(profenofos)、巴胺磷(propetamphos)、普硫松(prothiofos)、吡啶硫磷(pyraclofos)、噻嗪硫磷(pyridaphenthion)、喹惡磷(quinalphos)、治螟磷(sulfotep)、丁基嘧啶磷(tebupirimfos)、雙硫磷(temephos)、託福松(terbufos)、樂本松(tetrachlorvinphos)、甲基乙拌磷(thiometon)、三落松(triazophos)、三氯松(triclorfon)及蚜滅多(vamidothion)。

(2) GABA閘控氯離子通道阻斷劑，諸如環戊二烯-有機氯類，例如氯丹(chlordane)及安殺番(endosulfan)或苯基吡啶(非潑羅(fiproles))，例如乙蟲清(ethiprole)及費普尼(fipronil)。

(3) 鈉通道調節劑，諸如擬除蟲菊酯類(pyrethroids)，例如阿納寧

(acrinathrin)、丙烯除蟲菊酯(allethrin)、右旋順式反式丙烯除蟲菊酯(d-cis-trans allethrin)、右旋反式丙烯除蟲菊酯(d-trans allethrin)、畢芬寧(bifenthrin)、生物丙烯菊酯、生物丙烯菊酯s-環戊烯基異構體、苳呋菊脂(bioresmethrin)、乙氰菊脂(cycloprothrin)、賽扶寧(cyfluthrin)、β-賽扶寧、賽洛寧(cyhalothrin)、λ-賽洛寧、γ-賽洛寧、賽滅寧(cypermethrin)、α-賽滅寧、β-賽滅寧、θ-賽滅寧、ξ-賽滅寧、賽酚寧[(1R)-反式異構體]、第滅寧(deltamethrin)、烯炔菊酯[(EZ)-(1R)-異構體]、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(tau-fluvalinate)、苳蟊醚(halfenprox)、依普寧(imiprothrin)、噻恩菊酯(kadethrin)、沫氟寧(momfluorothrin)、百滅寧(permethrin)、苯醚菊酯[(1R)-反式異構體]、普亞列寧(prallethrin)、除蟲菊精(pyrethrins)(除蟲菊(pyrethrum))、苳呋菊脂(resmethrin)、矽護芬(silafluofen)、七氟菊酯(tefluthrin)、治滅寧(tetramethrin)、治滅寧[(1R)-異構體]、泰滅寧(tralomethrin)及拜富寧(transfluthrin)或DDT或甲氧滴滴涕(methoxychlor)。

(4)菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)競爭性調節劑，諸如新菸鹼類似物類，例如啖蟲脒(acetamiprid)、可尼丁(clothianidin)、呋蟲胺(dinotefuran)、吡蟲啉(imidacloprid)、烯啖蟲胺(nitenpyram)、噻蟲啉(thiacloprid)及噻蟲嗪(thiamethoxam)或菸鹼或氟啖蟲胺脒(sulfoxaflor)或氟吡呋喃酮(flupyradifurone)。

(5)菸鹼乙醯膽鹼受體(nAChR)異位調節劑，諸如賜諾殺類(spinosyn)，例如斯平托蘭(spinetoram)及賜諾殺(spinosad)。

(6)麩胺酸閘控氯離子通道(GluCl)異位調節劑，諸如阿維菌素類(ivermectin)/米爾倍黴素類(milbemycin)，例如阿巴汀(abamectin)、因滅汀苯甲酸酯(emamectin benzoate)、林皮沒丁(lepimectin)及密滅汀(milbemectin)。

(7)青少年激素模擬物，諸如青少年激素類似物，例如烯蟲乙酯(hydroprene)、烯蟲炔酯(kinoprene)及美賜平(methoprene)或芬諾克(fenoxycarb)或百利普芬(pyriproxyfen)。

(8)各種非特異性(多位點)抑制劑，諸如烷基鹵化物，例如溴化甲烷及其他烷基鹵化物；或氯化苦(chloropicrine)或磷醯氟或硼砂或牙垢催吐劑或異氰酸甲酯產生劑，例如必速滅(diazomet)及威百畝(metam)。

(9)弦音器之調節劑，諸如派滅淨(pymetrozine)或氟啶蟲醯胺(flonicamid)。

(10)蟎生長抑制劑，諸如克芬蟎(clofentezine)、合賽多(hexythiazox)及氟蟎嗪(diflovidazin)或依殺蟎(etoxazole)。

(11)昆蟲腸膜之微生物瓦解劑，諸如蘇力菌以色列亞種、枯草芽孢桿菌、蘇力菌亞莎華亞種、蘇力菌庫斯塔克亞種、蘇力菌擬步行甲亞種及蘇力菌植物蛋白：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1Fa、Cry1A.105、Cry2Ab、Vip3A、mCry3A、Cry3Ab、Cry3Bb、Cry34Ab1/35Ab1。

(12)粒線體ATP合成酶之抑制劑，諸如ATP瓦解劑，諸如汰芬諾克(diafenthiuron)或有機錫化合物，例如三唑錫(azocyclotin)、錫蟎丹(cyhexatin)及芬布錫(fenbutatin oxide)或毆蟎多(propargite)或四氯殺蟎砒(tetradifon)。

(13)經由破壞質子梯度氧化磷酸化之去偶合劑，諸如克凡派

(chlorfenapyr)、DNOC及氟蟲胺(sulfluramid)。

(14)菸鹼乙醯膽鹼受體通道阻斷劑，諸如殺蟲磺(bensultap)、培丹鹽酸鹽(cartap hydrochloride)、硫賜安(thiocylam)及殺蟲雙鈉(thiosultap-sodium)。

(15)甲殼素生物合成之抑制劑，0型，諸如雙三氟蟲脲(bistrifluron)、克福隆(chlorfluazuron)、二福隆(diflubenzuron)、氟環脲(flucycloxuron)、氟芬隆(flufenoxuron)、六伏隆(hexaflumuron)、祿芬隆(lufenuron)、諾伐隆(novaluron)、多氟脲(noviflumuron)、得福隆(teflubenzuron)及三福隆(triflumuron)。

(16)甲殼素生物合成之抑制劑，1型，例如布芬淨(buprofezin)。

(17)脫皮干擾劑(尤其用於雙翅目，亦即雙翅目昆蟲)，諸如賽滅淨(cyromazine)。

(18)蛻皮激素受體促效劑，諸如環蟲醯肼(chromafenozide)、合芬隆(halofenozide)、滅芬諾(methoxyfenozide)及得芬諾(tebufenozide)。

(19)章魚胺受體促效劑，諸如三亞蟎(amitraz)。

(20)粒線體複合物III電子傳輸抑制劑，諸如伏蟻脲(hydramethylnone)或亞醯蟎(acequinocyl)或嘧蟎酯(flucrypyrim)。

(21)粒線體複合物I電子傳輸抑制劑，諸如來自METI殺蟎劑之群組，例如芬殺蟎(fenazaquin)、芬普蟎(fenpyroximate)、嘧蟎醚(pyrimidifen)、比達本(pyridaben)、得芬瑞(tebufenpyrad)及脫芬瑞(tolfenpyrad)或魚藤酮(rotenone) (魚藤(Derris))。

(22)電壓依賴性鈉通道阻斷劑，諸如因得克(indoxacarb)或氰氟蟲胺(metaflumizone)。

(23)乙醯CoA羧化酶之抑制劑，諸如特窗酸(tetronic acid)及特特拉姆酸(tetramic acid)衍生物，例如賜派芬(spirodiclofen)、螺甲蟎酯(spiromesifen)及螺蟲乙酯(spirotetramat)。

(24)粒線體複合物IV電子傳輸抑制劑，諸如膦，例如磷化鋁、磷化鈣、膦及磷化鋅；或氰化物，例如氰化鈣、氰化鉀及氰化鈉。

(25)粒線體複合物II電子傳輸抑制劑，諸如 β -開托利(*beta*-ketonitrile)衍生物，例如腈吡蟎酯(cyenopyrafen)及丁氟蟎酯(cyflumetofen)，及甲苯胺類，諸如吡氟蟎酯(pyflubumide)。

(28)理阿諾鹼(Ryanodine)受體調節劑，諸如二醯胺類，例如氯蟲苯甲醯胺(chlorantraniliprole)、氰強尼普羅(cyantraniliprole)及氟蟲雙醯胺(flubendiamide)，

其他活性化合物，諸如雙丙環蟲酯(Afidopyropen)、阿福拉納(Afoxolaner)、印楝素(Azadirachtin)、苯氯噻(Benclothiaz)、苯蟎特(Benzoximate)、畢芬載(Bifenazate)、溴蟲氟苯雙醯胺(Broflanilide)、溴蟎酯(Bromopropylate)、蟎離丹(Chinomethionat)、氯丙炔菊酯(Chloroprallethrin)、冰晶石(Cryolite)、環溴蟲醯胺(Cyclaniliprole)、環氧蟲啉(Cycloxaprid)、氯氟氰蟲醯胺(Cyhalodiamide)、敵克美施(Dicloromezotiaz)、開樂散(Dicofol)、 ϵ -甲氧苄氟菊酯(*epsilon*-Metofluthrin)、 ϵ -單氟菊酯(*epsilon*-Momfluthrin)、孚蟎啞(Flometoquin)、三氟咪啉醯胺(Fluazaindolizine)、氟噻蟲磺(Fluensulfone)、氟芬內林(Flufenerim)、氟菌蟎酯(Flufenoxystrobin)、丁蟲腈(Flufiprole)、福薩豐(Fluhexafon)、氟吡菌醯胺(Fluopyram)、弗拉拉納(Fluralaner)、氣釀醯胺(Fluxametamide)、呋喃蟲醯肼(Fufenozide)、戊吡蟲胍(Guadipyr)、七

氟甲醚菊酯(Heptafluthrin)、氯噁啉(Imidaclothiz)、依普同(Iprodione)、
 κ-畢芬寧(kappa-Bifenthrin)、κ-七氟菊酯(kappa-Tefluthrin)、洛替拉納
 (Lotilaner)、氯氟醚菊酯(Meperfluthrin)、哌蟲啉(Paichongding)、啉蟲
 丙 醚(Pyridalyl)、哌 氟 喹 啉(Pyrifluquinazon)、嘧 蟎 胺
 (Pyriminostrobin)、螺 蛭 雙 酯(Spirobudiclofen)、四 氟 醚 菊 酯
 (Tetramethylfluthrin)、氟 氰 蟲 醯 胺(Tetraniliprole)、四 氯 蟲 醯 胺
 (Tetrachlorantraniliprole)、泰 格 藍 耳(Tigolaner)、硫 噁 唑 芬
 (Tioxazafen)、硫 氟 脲 醚(Thiofluoximate)、三 氟 苯 嘧 啉
 (Triflumezopyrim)及碘甲烷(iodomethane)；基於強固芽胞桿菌(*Bacillus
 firmus*)之其他製劑(I-1582, BioNeem, Votivo)，以及以下化合物：1-{2-
 氟-4-甲基-5-[(2,2,2-三氟乙基)亞磺醯基]苯基}-3-(三氟甲基)-1H-1,2,4-三
 唑-5-胺(自WO2006/043635已知) (CAS 885026-50-6)、{1'-[(2E)-3-(4-氯
 苯基)丙-2-烯-1-基]-5-氟螺[吡啶-3,4'-哌啶]-1(2H)-基}(2-氯吡啶-4-基)甲
 酮(自WO2003/106457已知) (CAS 637360-23-7)、2-氯-N-[2-{1-[(2E)-3-
 (4-氯 苯 基)丙-2-烯-1-基]哌啶-4-基}-4-(三 氟 甲 基)苯 基]異 菸 鹼 醯 胺(自
 WO2006/003494已知) (CAS 872999-66-1)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-4-
 羥基-8-甲氧基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(自WO 2010052161已知)
 (CAS 1225292-17-0)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-側氧基-1,8-
 二 氮 雜 螺[4.5]癸-3-烯-4-基 乙 基 碳 酸 鹽(自EP2647626已 知) (CAS
 1440516-42-6)、4-(丁-2-炔-1-基氧基)-6-(3,5-二甲基哌啶-1-基)-5-氟嘧啶
 (自WO2004/099160已 知) (CAS 792914-58-0)、PF1364 (自
 JP2010/018586已知) (CAS 1204776-60-2)、N-[(2E)-1-[(6-氯吡啶-3-基)
 甲基]吡啶-2(1H)-亞基]-2,2,2-三氟乙醯胺(自WO2012/029672已知) (CAS

1363400-41-2)、(3*E*)-3-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2-仲吡啶基]-1,1,1-三氟-丙-2-酮(自WO2013/144213已知)(CAS 1461743-15-6)、*N*-[3-(苯甲基胺甲醯基)-4-氯苯基]-1-甲基-3-(五氟乙基)-4-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-5-甲醯胺(自WO2010/051926已知)(CAS 1226889-14-0)、5-溴-4-氯-*N*-[4-氯-2-甲基-6-(甲基胺甲醯基)苯基]-2-(3-氯-2-吡啶基)吡唑-3-甲醯胺(自CN103232431已知)(CAS 1449220-44-3)、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-2-甲基-*N*-(順式-1-氧離子基-3-硫雜環丁基)-苯甲醯胺、4-[5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-2-甲基-*N*-(反式-1-氧離子基-3-硫雜環丁基)-苯甲醯胺及4-[(5*S*)-5-(3,5-二氯苯基)-4,5-二氫-5-(三氟甲基)-3-異噁唑基]-2-甲基-*N*-(順式-1-氧離子基-3-硫雜環丁基)苯甲醯胺(自WO 2013/050317 A1已知)(CAS 1332628-83-7)、*N*-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1*H*-吡唑-4-基]-*N*-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亞磺醯基]-丙醯胺、(+)-*N*-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1*H*-吡唑-4-基]-*N*-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亞磺醯基]-丙醯胺及(-)-*N*-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1*H*-吡唑-4-基]-*N*-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)亞磺醯基]-丙醯胺(自WO 2013/162715 A2、WO 2013/162716 A2、US 2014/0213448 A1已知)(CAS 1477923-37-7)、5-[[*(2E)*-3-氯-2-丙烯-1-基]胺基]-1-[2,6-二氯-4-(三氟甲基)苯基]-4-[(三氟甲基)亞磺醯基]-1*H*-吡唑-3-甲腈(自CN 101337937 A已知)(CAS 1105672-77-2)、3-溴-*N*-[4-氯-2-甲基-6-[(甲胺基)硫代甲基]苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡唑-5-甲醯胺(硫代苯甲醯胺，自CN 103109816 A已知)(CAS 1232543-85-9)；*N*-[4-氯-2-[(1,1-二甲基乙基)胺基]羰基]-6-甲基苯基]-1-(3-氯-2-吡啶基)-3-(氟甲氧基)-1*H*-吡唑-5-甲醯胺(自WO 2012/034403 A1已知)(CAS 1268277-22-0)、*N*-[2-(5-胺基-1,3,4-噻二唑-

2-基)-4-氯-6-甲基苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡啶-5-甲醯胺(自WO 2011/085575 A1已知) (CAS 1233882-22-8)、4-[3-[2,6-二氯-4-[(3,3-二氯-2-丙烯-1-基)氧基]苯氧基]丙氧基]-2-甲氧基-6-(三氟甲基)-嘧啶(自CN 101337940 A已知) (CAS 1108184-52-6)；(2*E*)-2-[2-(4-氰基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亞乙基]-*N*-[4-(二氟甲氧基)苯基]-肼甲醯胺及2(*Z*)-2-[2-(4-氰基苯基)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亞乙基]-*N*-[4-(二氟甲氧基)苯基]-肼甲醯胺(自CN 101715774 A已知) (CAS 1232543-85-9)；3-(2,2-二氯乙基)-2,2-二甲基-4-(1*H*-苯并咪唑-2-基)苯基-環丙烷甲酸酯(自CN 103524422 A已知) (CAS 1542271-46-4)；(4*aS*)-7-氯-2,5-二氫-2-[[[(甲氧基羰基)[4-[(三氟甲基)硫基]苯基]胺基]羰基]-茚并[1,2-*e*][1,3,4]噁二嗪-4*a*(3*H*)-甲酸甲酯(自CN 102391261 A已知) (CAS 1370358-69-2)；6-去氧-3-*O*-乙基-2,4-二-*O*-甲基-、1-[*N*-[4-[1-[4-(1,1,2,2,2-五氟乙氧基)苯基]-1*H*-1,2,4-三唑-3-基]苯基]胺基]甲酸酯]- α -*L*-吡喃甘露糖(自US 2014/0275503 A1已知) (CAS 1181213-14-8)；8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基-苯氧基)-3-(6-三氟甲基-噻吩-3-基)-3-氮雜-雙環[3.2.1]辛烷(CAS 1253850-56-4)、(8-反式)-8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基-苯氧基)-3-(6-三氟甲基-噻吩-3-基)-3-氮雜-雙環[3.2.1]辛烷(CAS 933798-27-7)、(8-順式)-8-(2-環丙基甲氧基-4-三氟甲基-苯氧基)-3-(6-三氟甲基-噻吩-3-基)-3-氮雜-雙環[3.2.1]辛烷(自WO 2007040280 A1、WO 2007040282 A1已知) (CAS 934001-66-8)、*N*-[3-氯-1-(3-吡啶基)-1*H*-吡啶-4-基]-*N*-乙基-3-[(3,3,3-三氟丙基)硫基]-丙醯胺(自WO 2015/058021 A1、WO 2015/058028 A1已知) (CAS 1477919-27-9)及*N*-[4-(胺基硫代甲基)-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-1*H*-吡啶-5-甲醯胺(自

CN 103265527 A已知) (CAS 1452877-50-7)、5-(1,3-二噁烷-2-基)-4-[[4-(三氟甲基)苯基]甲氧基]-嘧啶(自WO 2013/115391 A1已知) (CAS 1449021-97-9)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-4-羥基-8-甲氧基-1-甲基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸-3-烯-2-酮(自WO 2010/066780 A1、WO 2011/151146 A1已知) (CAS 1229023-34-0)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-1-甲基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸烷-2,4-二酮(自WO 2014/187846 A1已知) (CAS 1638765-58-8)、3-(4-氯-2,6-二甲基苯基)-8-甲氧基-1-甲基-2-側氧基-1,8-二氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基-碳酸乙酯(自WO 2010/066780 A1、WO 2011/151146 A1已知) (CAS 1229023-00-0)、N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2(1*H*)-伸吡啶基]-2,2,2-三氟-乙醯胺(自DE 3639877 A1、WO 2012/029672 A1已知) (CAS 1363400-41-2)、[N(*E*)]-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2(1*H*)-伸吡啶基]-2,2,2-三氟-乙醯胺(自WO 2016/005276 A1已知) (CAS 1689566-03-7)、[N(*Z*)]-N-[1-[(6-氯-3-吡啶基)甲基]-2(1*H*)-伸吡啶基]-2,2,2-三氟-乙醯胺(CAS 1702305-40-5)、3-內-3-[2-丙氧基-4-(三氟甲基)苯氧基]-9-[[5-(三氟甲基)-2-吡啶基]氧基]-9-氮雜雙環[3.3.1]壬烷(自WO 2011/105506 A1、WO 2016/133011 A1已知) (CAS 1332838-17-1)。

【0132】可與本發明之化合物及組合物混合的安全劑之實例為：例如解草酮(benoxacor)、解毒啞(-庚酯) (cloquintocet (-mexyl))、解草胺腈(cyometrinil)、環丙磺醯胺、二氯丙烯胺、解草啞(-乙酯) (fenchlorazole (-ethyl))、解草啞(fenclorim)、解草安(flurazole)、肱草安(fluxofenim)、呋喃解草啞(furilazole)、雙苯噁啞酸(-乙酯) (isoxadifen (-ethyl))、吡啞解草酯(-二乙酯) (mefenpyr (-diethyl))、萘二甲酸酐、解草腈

(oxabetrinil)、2-甲氧基-N-({4-[(甲基胺甲醯基)胺基]苯基}磺醯基)苯甲醯胺(CAS 129531-12-0)、4-(二氯乙醯基)-1-氧雜-4-氮雜螺[4.5]癸烷(CAS 71526-07-3)、2,2,5-三甲基-3-(二氯乙醯基)-1,3-噁唑啉(CAS 52836-31-4)。

【0133】可與本發明之化合物及組合物混合的除草劑之實例為：

乙草胺(Acetochlor)、三氟羧草醚(acifluorfen)、三氟羧草醚鈉、苯草醚(aclonifen)、甲草胺(alachlor)、草毒死(allidochlor)、禾草滅(alloxydim)、禾草滅鈉、莠滅淨(amestryl)、胺唑草酮(amicarbazone)、先甲草胺(amidochlor)、噻嘧磺隆(amidosulfuron)、4-胺基-3-氯-6-(4-氯-2-氟-3-甲基苯基)-5-氟吡啶-2-甲酸、環丙嘧啶酸(aminocyclopyrachlor)、環丙嘧啶酸鉀、環丙嘧啶酸甲酯(aminocyclopyrachlor-methyl)、氯胺吡啶酸(aminopyralid)、殺草強(amitrole)、胺基磺酸銨(ammoniumsulfamate)、莎稗磷(anilofos)、黃草靈(asulam)、莠去津(atrazine)、草芬定(azafenidin)、四唑嘧磺隆(azimsulfuron)、氟丁噻草胺(beflubutamid)、草除靈(benazolin)、草除靈乙酯(benazolin-ethyl)、氟草胺(benfluralin)、呋草磺(benfuresate)、苄嘧磺隆(bensulfuron)、苄嘧磺隆甲酯(bensulfuron-methyl)、地散磷(bensulide)、滅草松(bentazone)、苯并雙環酮(benzobicyclon)、吡草酮(benzofenap)、雙環比隆(bicyclopyron)、必芬諾(bifenox)、畢拉草(bilanafos)、畢拉草鈉、雙草醚(bispyribac)、雙草醚鈉、除草定(bromacil)、溴丁噻草胺(bromobutide)、殺草全(bromofenoxim)、溴苯腈(bromoxynil)、溴苯腈丁酸鹽(bromoxynil-butyrate)、溴苯腈鉀、溴苯腈庚酸鹽及溴苯腈辛酸鹽；羥草酮(busoxinone)、丁草胺(butachlor)、氟丙嘧草酯

(butafenacil)、抑草磷(butamifos)、丁烯草胺(butenachlor)、比達寧(butralin)、丁苯草酮(butroxydim)、丁草敵(butylate)、唑草胺(cafenstrole)、長殺草(carbetamide)、克繁草(carfentrazone)、克繁草乙酯(carfentrazone-ethyl)、克爛本(chloramben)、氯溴隆(chlorbromuron)、伐草克(chlorfenac)、伐草克鈉、燕麥酯(chlorfenprop)、氯甲丹(chlorflurenol)、氯甲丹甲酯(chlorflurenol-methyl)、氯草敏(chloridazon)、氯嘧磺隆(chlorimuron)、氯嘧磺隆乙酯(chlorimuron-ethyl)、氯肽亞胺(chlorophthalim)、綠麥隆(chlorotoluron)、敵草索二甲酯(chlorthal-dimethyl)、氯磺隆(chlorsulfuron)、吲哚酮草酯(cinidon)、吲哚酮草酯乙酯(cinidon-ethyl)、環庚草醚(cinmethylin)、醚磺隆(cinosulfuron)、氯醯草膦(clacyfos)、克草同(clethodim)、炔草酸(clodinafop)、炔草酸炔丙酯(clodinafop-propargyl)、可滅蹤(clomazone)、稗草胺(clomeprop)、畢克草(clopyralid)、氯酯磺草胺(cloransulam)、氯酯磺草胺甲酯(cloransulam-methyl)、苣草隆(cumyluron)、氰胺(cyanamide)、氰草津(cyanazine)、環草敵(cycloate)、環吡嘧啶(cyclopyrimorate)、環磺隆(cyclosulfamuron)、環殺草(cycloxydim)、氰氟草酯(cyhalofop)、氰氟草酯丁酯(cyhalofop-butyl)、環草津(cyprazine)、2,4-D、2,4-D-丁氧基乙酯(2,4-D-butotyl)、2,4-D-丁酯、2,4-D-二甲基銨、2,4-D-二醇胺、2,4-D-乙酯、2,4-D-2-乙基己酯、2,4-D-異丁酯、2,4-D-異辛酯、2,4-D-異丙銨、2,4-D-鉀、2,4-D-三異丙醇銨(2,4-D-triisopropanolammonium)及2,4-D-三醇胺、2,4-DB、2,4-DB-丁酯、2,4-DB-二甲基銨、2,4-DB-異辛酯、2,4-DB-鉀及2,4-DB-鈉；殺草隆(daimuron/dymron)、茅草枯(dalapon)、

邁隆(dazomet)、正癸醇、甜菜安(desmedipham)、脫甲苯磺醯-吡唑特
(detosyl-pyrazolate) (DTP)、麥草畏(dicamba)、敵草腈(dichlobenil)、2-
(2,4-二氯苯甲基)-4,4-二甲基-1,2-噁唑啉-3-酮、2-(2,5-二氯苯甲基)-4,4-
二甲基-1,2-噁唑啉-3-酮、滴丙酸(dichlorprop)、滴丙酸-P (dichlorprop-
P)、禾草靈(diclofop)、禾草靈甲酯(diclofop-methyl)、禾草靈-P-甲酯
(diclofop-P-methyl)、雙氯磺草胺(diclosulam)、苯敵快(difenzoquat)、
吡氟草胺(di flufenican)、二氟吡隆(di flufenzopyr)、二氟吡隆-鈉、噁唑
隆(dimefuron)、哌草丹(dimepiperate)、二甲草胺(dimethachlor)、異戊
乙淨(dimethametryn)、二甲噻草胺(dimethenamid)、二甲噻草胺-P
(dimethenamid-P)、醚菌酯(dimetrasulfuron)、敵樂胺(dinitramine)、特
樂酚(dinoterb)、草乃敵(diphenamid)、敵草快(diquat)、敵草快二溴
(diquat-dibromid)、氟硫草定(dithiopyr)、達有龍(diuron)、DNOC、草多
索(endothal)、EPTC、戊草丹(esprocarb)、乙丁烯氟靈(ethalfluralin)、
胺苯磺隆(ethametsulfuron)、胺苯磺隆甲酯(ethametsulfuron-methyl)、乙
噻草酮(ethiozin)、乙呋草黃(ethofumesate)、氯氟草醚(ethoxyfen)、氯氟
草醚乙酯(ethoxyfen-ethyl)、乙氧嘧磺隆(ethoxysulfuron)、乙氧苯草胺
(etobenzanid)、F-9600、F-5231 (亦即，N-{2-氯-4-氟-5-[4-(3-氟丙基)-
5-側氧基-4,5-二氫-1H-四唑-1-基]苯基}乙磺醯胺)、F-7967 (亦即，3-[7-
氯-5-氟-2-(三氟甲基)-1H-苯并咪唑-4-基]-1-甲基-6-(三氟甲基)嘧啶-
2,4(1H,3H)-二酮)、噁唑禾草靈(fenoxaprop)、噁唑禾草靈-P
(fenoxaprop-P)、噁唑禾草靈乙酯(fenoxaprop-ethyl)、噁唑禾草靈-P-乙
酯(fenoxaprop-P-ethyl)、異噁苯磺(fenoxasulfone)、芬昆諾三酮
(fenquinotrione)、四唑醯草胺(fentrazamide)、麥草伏(flamprop)、麥草

伏-M-異丙酯(flamprop-M-isopropyl)、麥草伏-M-甲酯(flamprop-M-methyl)、嘧啶磺隆(flazasulfuron)、雙氟磺草胺(florasulam)、吡氟禾草靈(fluzifop)、吡氟禾草靈-P (fluzifop-P)、吡氟禾草靈丁酯(fluzifop-butyl)、吡氟禾草靈-P-丁酯(fluzifop-P-butyl)、氟酮磺隆(flucarbazone)、氟酮磺隆-鈉(flucarbazone-sodium)、氟吡磺隆(flucetosulfuron)、氟消草(fluchloralin)、氟噻草胺(flufenacet)、氟噻嗪草酯(flufenpyr)、氟噻嗪草酯乙酯(flufenpyr-ethyl)、唑嘧磺草胺(flumetsulam)、氟烯草酸(flumiclorac)、氟烯草酸戊酯(flumiclorac-pentyl)、丙炔氟草胺(flumioxazin)、伏草隆(fluometuron)、抑草丁(flurenol)、抑草丁丁酯(flurenol-butyl)、抑草丁二甲基銨(flurenol-dimethylammonium)及抑草丁甲酯(flurenol-methyl)、乙羧氟草醚(fluoroglycofen)、乙羧氟草醚乙酯(fluoroglycofen-ethyl)、四氟丙酸(flupropanate)、氟啶嘧磺隆(flupyrsulfuron)、氟啶嘧磺隆-甲基-鈉(flupyrsulfuron-methyl-sodium)、氟啶草酮(fluridone)、氟咯草酮(flurochloridone)、氟草定(fluroxypyr)、氟草定甲基庚酯(fluroxypyr-meptyl)、呋草酮(flurtamone)、氟噻草酯(fluthiacet)、氟噻甲草酯甲酯(fluthiacet-methyl)、氟磺胺草醚(fomesafen)、氟磺胺草醚-鈉、甲醯嘧磺隆(foramsulfuron)、殺木磷(fosamine)、草銨磷(glufosinate)、草銨磷-銨(glufosinate-ammonium)、精草銨-P-鈉(glufosinate-P-sodium)、精草銨-P-銨、精草銨-P-鈉、草甘磷(glyphosate)、草甘磷銨(glyphosate-ammonium)、草甘磷異丙銨(glyphosate-isopropylammonium)、草甘磷二銨(glyphosate-diammonium)、草甘磷二甲銨(glyphosate-dimethylammonium)、草甘磷鉀(glyphosate-potassium)、草甘磷鈉

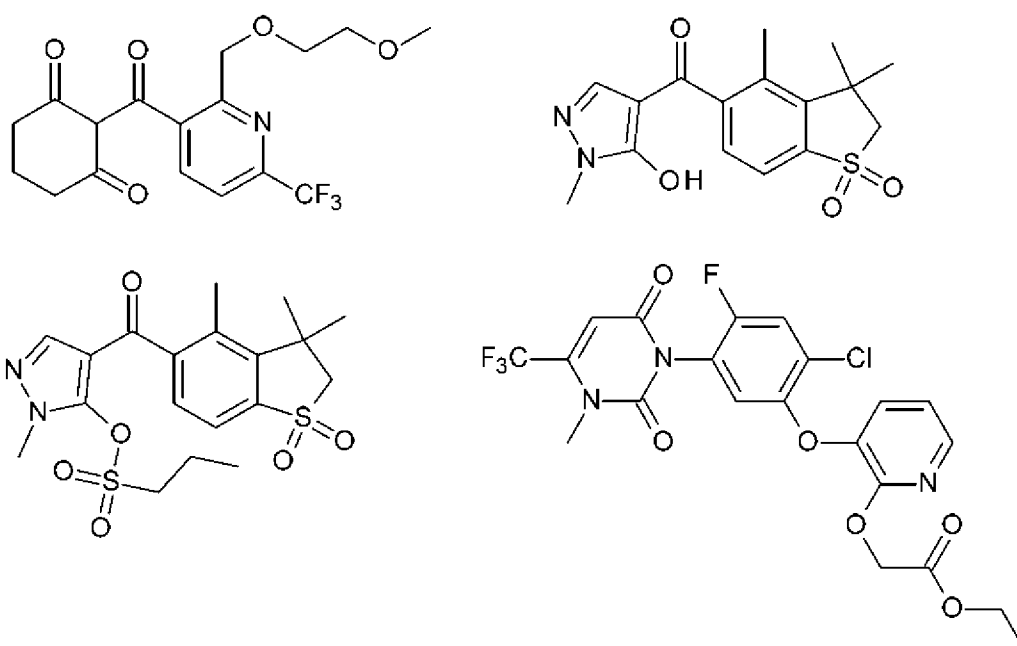
(glyphosate-sodium)及草甘膦三甲基硫(glyphosate-trimesium)、H-9201 (亦即，異丙基硫代磷醯胺O-(2,4-二甲基-6-硝基苯酯)O-乙酯)、氟氯吡啶酯(halauxifen)、氟氯吡啶酯甲酯(halauxifen-methyl)、氟硝磺醯胺(halosafen)、氯吡嘧磺隆(halosulfuron)、氯吡嘧磺隆甲酯(halosulfuron-methyl)、吡氟氯禾靈(haloxifop)、吡氟氯禾靈-P (haloxifop-P)、吡氟氯禾靈-乙氧基乙酯(haloxifop-ethoxyethyl)、吡氟氯禾靈-P-乙氧基乙酯(haloxifop-P-ethoxyethyl)、吡氟氯禾靈甲酯(haloxifop-methyl)、吡氟氯禾靈-P-甲酯(haloxifop-P-methyl)、六嗪酮(hexazinone)、HW-02 (亦即，乙基-(2,4-二氯苯氧基)乙酸1-(二甲氧基磷醯酯))、咪草酸(imazamethabenz)、咪草酸甲酯(imazamethabenz-methyl)、甲氧咪草菸(imazamox)、甲氧咪草菸銨(imazamox-ammonium)、甲基咪草菸(imazapic)、甲基咪草菸銨(imazapic-ammonium)、依滅草(imazapyr)、依滅草-異丙銨(imazapyr-isopropylammonium)、滅草啞(imazaquin)、滅草啞銨(imazaquin-ammonium)、咪草菸(imazethapyr)、咪草菸亞胺鎘(imazethapyr-immonium)、唑吡嘧磺隆(imazosulfuron)、茚草酮(indanofan)、茚嗪氟草胺(indaziflam)、碘甲磺隆(iodosulfuron)、碘甲磺隆-甲基-鈉(iodosulfuron-methyl-sodium)、碘苯腈(ioxynil)、碘苯腈辛酸鹽(ioxynil-octanoate)、碘苯腈鉀(ioxynil-potassium)及碘苯腈鈉(ioxynil-sodium)、三唑醯草胺(ipfencarbazone)、異丙隆(isoproturon)、異惡隆(isouron)、異噁草胺(isoxaben)、異噁唑草酮(isoxaflutole)、卡草靈(karbutilate)、KUH-043 (亦即，3-([5-(二氟甲基)-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-基]甲基}磺醯基)-5,5-二甲基-4,5-二氫-1,2-噁唑)、酮吡咯(ketospiradox)、乳氟禾草靈(lactofen)、環草定(lenacil)、利谷隆

(linuron)、MCPA、MCPA-丁氧基乙酯(MCPA-butotyl)、MCPA-二甲基銨(MCPA-dimethylammonium)、MCPA-2-乙基己酯(MCPA-2-ethylhexyl)、MCPA-異丙銨(MCPA-isopropylammonium)、MCPA-鉀(MCPA-potassium)及MCPA-鈉(MCPA-sodium)；MCPB、MCPB-甲酯(MCPB-methyl)、MCPB-乙酯(MCPB-ethyl)及MCPB-鈉(MCPB-sodium)；甲氯丙酸(mecoprop)、甲氯丙酸鈉(mecoprop-sodium)及甲氯丙酸丁氧基乙酯(mecoprop-butotyl)、甲氯丙酸-P (mecoprop-P)、甲氯丙酸-P-丁氧基乙酯(mecoprop-P-butotyl)、甲氯丙酸-2-乙基己酯(mecoprop-2-ethylhexyl)及甲氯丙酸鉀(mecoprop-potassium)、苯噻醯草胺(mefenacet)、氟磺醯草胺(mefluidide)、甲基二磺隆(mesosulfuron)、甲基二磺隆甲酯(mesosulfuron-methyl)、甲基磺草酮(mesotrione)、甲基苯噻隆(methabenzthiazuron)、威百畝(metam)、噁唑醯草胺(metamifop)、苯嗪草酮(metamitron)、吡草胺(metazachlor)、雙醚氯吡啶磺隆(metazosulfuron)、甲基苯噻隆、甲硫嘧磺隆(methiopyrsulfuron)、甲硫唑啉(methiozolin)、異硫氰酸甲酯(methyl isothiocyanate)、溴谷隆(metobromuron)、異丙甲草胺(metolachlor)、S-異丙甲草胺(S-metolachlor)、磺草唑胺(metosulam)、甲氧隆(metoxuron)、賽克津(metribuzin)、甲磺隆(metsulfuron)、甲磺隆甲酯(metsulfuron-methyl)、禾草敵(molinat)、綠谷隆(monolinuron)、單嘧磺隆(monosulfuron)、單嘧磺隆酯(monosulfuron-ester)、MT-5950 (亦即，N-(3-氯-4-異丙基苯基)-2-甲基戊醯胺)、NGGC-011、敵草胺(napropamide)、NC-310 (亦即，[5-(苯甲氧基)-1-甲基-1H-吡唑-4-基](2,4-二氯苯基)甲酮)、草不隆(neburon)、菸嘧磺隆(nicosulfuron)、壬酸(nonanoic acid/pelargonic

acid)、達草滅(norflurazon)、油酸(脂肪酸)、坪草丹(orbencarb)、噻苯胺
 磺隆(orthosulfamuron)、氨磺樂靈(oryzalin)、丙炔噁草酮(oxadiargyl)、
 噁草酮(oxadiazon)、環氧噻磺隆(oxasulfuron)、環氧梓環隆
 (oxaziclomefon)、乙氧氟草醚(oxyfluorfen)、百草枯(paraquat)、百草枯
 二氯化物(paraquat dichloride)、克草猛(pebulate)、二甲戊樂靈
 (pendimethalin)、平速爛(penoxsulam)、五氯苯酚(pentachlorophenol)、
 環戊噁草酮(pentoxazone)、烯草胺(pethoxamid)、石油(petroleum oils)、
 甜菜寧(phenmedipham)、胺氯吡啶酸(picloram)、氟吡草胺
 (picolinafen)、唑啞草酯(pinoxaden)、哌草磷(piperophos)、丙草胺
 (pretilachlor)、氟噻磺隆(primisulfuron)、氟噻磺隆甲酯(primisulfuron-
 methyl)、胺基丙氟靈(prodiamine)、環苯草酮(profoxydim)、撲滅通
 (prometon)、撲草淨(prometryn)、撲草胺(propachlor)、敵稗(propanil)、
 噁草酸(propaquizafop)、撲滅津(propazine)、苯胺靈(propham)、異丙草
 胺(propisochlor)、丙苯磺隆(propoxycarbazone)、丙苯磺隆鈉
 (propoxycarbazone-sodium)、丙噻磺隆(propyrisulfuron)、戊炔草胺
 (propyzamide)、苄草丹(prosulfocarb)、氟磺隆(prosulfuron)、雙唑草腈
 (pyraclonil)、吡草醚(pyraflufen)、吡草醚乙酯(pyraflufen-ethyl)、磺醯
 草吡啶(pyrasulfotole)、吡啶特(pyrazolynate/pyrazolate)、吡噻磺隆
 (pyrazosulfuron)、吡噻磺隆乙酯(pyrazosulfuron-ethyl)、苄草啞
 (pyrazoxyfen)、草醚(pyribambenz)、異丙酯草醚(pyribambenz-
 isopropyl)、丙酯草醚(pyribambenz-propyl)、噻啶肟草醚
 (pyribenzoxim)、稗草丹(pyributicarb)、吡啶達醇(pyridafol)、噻草特
 (pyridate)、環酯草醚(pyriftalid)、噻草醚(pyriminobac)、噻草醚甲酯

(pyriminobac-methyl)、嘧啶硫蕃(pyrimisulfan)、嘧硫草醚(pyrithiobac)、嘧硫草醚鈉(pyrithiobac-sodium)、嘧吡草唑(pyroxasulfone)、甲氧磺草胺(pyroxulam)、二氯喹啉酸(quinclorac)、喹草酸(quinmerac)、滅藻醌(quinoclamine)、喹禾靈(quizalofop)、喹禾靈乙酯(quizalofop-ethyl)、精喹禾靈-P (quizalofop-P)、喹禾靈-P-乙酯(quizalofop-P-ethyl)、喹禾靈-P-糠酯(quizalofop-P-tefuryl)、嘧啶磺隆(rimsulfuron)、苯嘧磺草胺(saflufenacil)、烯禾啉(sethoxydim)、環草隆(siduron)、西瑪津(simazine)、西草淨(simetryn)、SL-261、磺草酮(sulcotrion)、甲磺草胺(sulfentrazone)、甲嘧磺隆(sulfometuron)、甲嘧磺隆甲酯(sulfometuron-methyl)、磺醯磺隆(sulfosulfuron)、SYN-523、SYP-249 (亦即，5-[2-氯-4-(三氟甲基)苯氧基]-2-硝基苯甲酸1-乙氧基-3-甲基-1-側氧基丁-3-烯-2-基酯)、SYP-300 (亦即，1-[7-氟-3-側氧基-4-(丙-2-炔-1-基)-3,4-二氫-2H-1,4-苯并噁嗪-6-基]-3-丙基-2-硫代咪唑啉-4,5-二酮)、2,3,6-TBA、TCA (三氯乙酸)、TCA-鈉、丁噻隆(tebuthiuron)、特糠酯酮(tefuryltrione)、環磺酮(tembotrione)、吡喃草酮(tepraloxymid)、特草定(terbacil)、特草靈(terbucarb)、甲氧去草淨(terbumeton)、特丁津(terbuthylazin)、特丁淨(terbutryn)、甲氧噻草胺(thenylchlor)、噻草啞(thiazopyr)、噻酮磺隆(thiencarbazon)、噻酮磺隆甲酯(thiencarbazon-methyl)、噻吩磺隆(thifensulfuron)、噻吩磺隆甲酯(thifensulfuron-methyl)、禾草丹(thiobencarb)、替艾芬斯(tiafenacil)、托拉唑胺(tolpyralate)、苯吡唑草酮(topramezone)、肱草酮(tralkoxydim)、氟酮磺草胺(triafamone)、野麥畏(tri-allate)、醚苯磺隆(triasulfuron)、三嗪氟草胺(triaziflam)、苯磺隆(tribenuron)、苯磺隆甲

酯(tribenuron-methyl)、綠草定(triclopyr)、草達津(trietazine)、三氟啶磺隆(trifloxysulfuron)、三氟啶磺隆-鈉(trifloxysulfuron-sodium)、三氟草嗪(trifludimoxazin)、氟樂靈(trifluralin)、氟胺磺隆(triflusulfuron)、氟胺磺隆甲酯(triflusulfuron-methyl)、三氟甲磺隆(tritosulfuron)、硫酸脲(urea sulfate)、滅草敵(vernolate)、XDE-848、ZJ-0862 (亦即, 3,4-二氯-N-{2-[(4,6-二甲氧基嘓啶-2-基)氧基]苯甲基}苯胺), 以及以下化合物:



【0134】 植物生長調節劑之實例為：

活化酯、活化酯-S-甲基、5-胺基乙醯丙酸、嘓啶醇、6-苯甲基胺基嘓啶、芸苔素內酯(Brassinolid)、兒茶素(catechine)、氯化克美素(chlormequat chloride)、坐果安(cloprop)、環丙酸醯胺(cyclanilide)、3-(環丙-1-烯基)丙酸、丁醯肼(daminozide)、邁隆(dazomet)、正癸醇、敵草克(dikegulac)、敵草克鈉(dikegulac-sodium)、草多索(endothal)、草多索二鉀(endothal-dipotassium)、草多索二鈉及草多索單(N,N-二甲基烷基銨)、益收生長素(ethephon)、氟節胺(flumetralin)、抑草丁(flurenol)、抑

草丁丁酯(flurenol-butyl)、調嘧醇(flurprimidol)、氯吡脞(forchlorfenuron)、赤黴酸(gibberellic acid)、依納素(inabenfide)、吲哚-3-乙酸(IAA)、4-吲哚-3-基丁酸、稻瘟靈(isoprothiolane)、撲殺熱、茉莉酸(jasmonic acid)、順丁烯二醯肼、氯化壯棉素(mepiquat chloride)、1-甲基環丙稀、茉莉酸甲酯、2-(1-萘基)乙醯胺、1-萘基乙酸、2-萘氧基乙酸、硝基酚鹽混合物、巴克素(paclobutrazol)、N-(2-苯乙基)- β -丙胺酸、N-苯基鄰胺甲醯苯甲酸、調環酸(prohexadione)、調環酸鈣(prohexadione-calcium)、茉莉酮(prohydrojasmane)、水楊酸、獨腳金內酯(strigolactone)、四氯硝基苯(tecnazene)、噻苯隆(thidiazuron)、三十烷醇(triacontanol)、抗倒酯(trinexapac)、抗倒酯(trinexapac-ethyl)、斯脫得(tsitodef)、烯效唑(uniconazole)、烯效唑-P (uniconazole-P)。

【0135】

方法及用途

本發明之化合物及組合物具有強植物防禦調節潛能。其可用於控制非所要細菌，尤其菌屬黃單胞菌之細菌。本發明之化合物及組合物可用於保護種子、發芽種子、萌出之幼苗、植物、植物部分、果實、收穫貨物及/或植物生長之土壤。

【0136】 如本文所使用，控制(control/controlling)涵蓋非所要微生物之預防性、保護性、治癒性及根除性處理。

【0137】 因此，本發明係關於一種用於控制由菌屬黃單胞菌之細菌所引起之細菌性病害的方法，其包含以下步驟：將至少一種本發明化合物或至少一種本發明組合物施加至植物、植物部分、種子、果實或植物生長之土壤。

【0138】 通常，當本發明之化合物及組合物用於控制細菌性病害之治癒性或保護性方法時，將其有效量及植物可相容量施加至植物、植物部分、果實、種子或植物生長之土壤或基質。可用於培育植物之適合基質包括基於無機物之基質，諸如礦棉，尤其岩棉、珍珠岩、砂或礫石；有機基質，諸如泥炭、松樹皮或鋸屑；及基於石油之基質，諸如聚合泡沫或塑膠珠粒。有效量及植物可相容量意謂足以控制耕地上存在或易在耕地上出現之細菌且不會引起該等作物之任何顯著植物毒性症狀的量。視待控制之病原體、作物類型、作物生長階段、氣候條件及所使用本發明之各別化合物或組合物而定，此量可在廣泛圍內變化。此量可藉由熟習此項技術者能力範圍內之系統田間試驗來測定。由細菌性病原體(例如，黃單胞菌屬(例如，野油菜黃單胞菌水稻致病變種(*Xanthomonas campestris* pv. *Oryzae*))、假單胞菌屬(例如，丁香假單胞菌甜瓜致病變種(*Pseudomonas syringae* pv. *Lachrymans*))、歐文種屬(例如，解澱粉歐文菌(*Erwinia amylovora*)))所引起之病害可由本發明之化合物控制。式(I)化合物亦可有效用於控制植物上之植物病原性真菌。

【0139】

植物及植物部分

本發明之化合物及組合物可施加至任何植物或植物部分。

【0140】 植物意謂所有植物及植物群體，諸如所需及非所需野生植物或作物植物(包括天然存在之作物植物)。作物植物可為可藉由習知育種及最佳方法或藉由生物技術及基因工程改造方法或此等方法之組合獲得的植物，包括經基因修飾之植物(GMO或轉殖基因植物)及可受植物育種者權利保護及不受植物育種者權利保護的植物栽培品種。

【0141】*經基因修飾之植物(GMO)*

經基因修飾之植物(GMO或轉殖基因植物)為其中異源基因已穩定整合於基因組中之植物。表述「異源基因」基本上意謂在植物外部且在引入核、葉綠體或粒線體基因組中時提供或組裝的基因。此基因藉由表現相關蛋白質或多肽或藉由下調或靜默植物中存在之其他基因(使用例如反義技術、共抑制技術、RNA干擾-RNAi技術或微RNA-miRNA技術)給予轉化植物新的或經改良農藝特性或其他特性。位於基因組中之異源基因亦稱為轉殖基因。由在植物基因組中之特定位置定義的轉殖基因稱為轉化或轉殖基因事件。

【0142】 植物栽培品種應理解為意謂具有新型特性(「性狀(traits)」)且已藉由習知育種、藉由誘變或藉由重組DNA技術獲得的植物。其可為栽培品種、變種、生物型或基因型。

【0143】 植物部分應理解為意謂地上及地下之植物的所有部分及器官，諸如幼芽、葉片、針葉、莖(stalk)、莖幹(stem)、花朵、果實體、果實、種子、根部、塊莖及根莖。植物部分亦包括收穫之物質及無性與有性繁殖物質，例如插條、塊莖、根莖、幼枝及種子。

【0144】 可根據本發明之方法處理之植物包括以下：棉、亞麻、葡萄藤、果實、蔬菜，諸如薔薇科種屬(*Rosaceae sp.*) (例如，梨果，諸如蘋果及梨，以及核果，諸如杏、櫻桃、杏仁及桃，及軟果實，諸如草莓)、茶藨子科種屬(*Ribesioideae sp.*)、胡桃科種屬(*Juglandaceae sp.*)、樺科種屬(*Betulaceae sp.*)、漆樹科種屬(*Anacardiaceae sp.*)、山毛櫸科種屬(*Fagaceae sp.*)、桑科種屬(*Moraceae sp.*)、木樨科種屬(*Oleaceae sp.*)、

繡猴桃科種屬(*Actinidaceae sp.*)、樟科種屬(*Lauraceae sp.*)、芭蕉科種屬(*Musaceae sp.*) (例如，香蕉樹及種植物)、茜草科種屬(*Rubiaceae sp.*) (例如，咖啡豆)、茶科種屬(*Theaceae sp.*)、梧桐科種屬(*Sterculiaceae sp.*)、芸香科種屬(*Rutaceae sp.*) (例如，檸檬、橙及葡萄柚)；茄科種屬(*Solanaceae sp.*) (例如，蕃茄)、百合科(*Liliaceae sp.*)、菊科(*Asteraceae sp.*) (例如，萵苣)、傘形科種屬(*Umbelliferae sp.*)、十字花科種屬(*Cruciferae sp.*)、藜科種屬(*Chenopodiaceae sp.*)、葫蘆科種屬(*Cucurbitaceae sp.*) (例如，胡瓜)、蔥科種屬(*Alliaceae sp.*) (例如，韭菜、洋蔥)、蝶形花科種屬(*Papilionaceae sp.*) (例如，豆類)；主要作物植物，諸如禾本科種屬(*Gramineae sp.*) (例如，玉米、草皮、穀物，諸如小麥、粗麥、水稻、大麥、燕麥、粟及黑小麥)、菊科種屬(*Asteraceae sp.*) (例如，向日葵)、芸苔科種屬(*Brassicaceae sp.*) (例如，白甘藍菜、紅甘藍菜、椰菜、花椰菜、球芽甘藍、白菜、球莖甘藍、小蘿蔔及油菜、芥末、辣根及水芹)、豆科種屬(*Fabaceae sp.*) (例如，豆類、花生)、蝶形花科種屬(*Papilionaceae sp.*) (例如，大豆)、茄科種屬(*Solanaceae sp.*) (例如，馬鈴薯)、藜科種屬(*Chenopodiaceae sp.*) (例如，糖用甜菜、飼料甜菜、紅頭菜、甜菜)；適用的植物及用於園林及森林區域之觀賞植物；及經基因修飾之各種各樣的此等植物中之每一者。

【0145】 可藉由上文所揭示之方法處理的植物及植物栽培品種包括對一或多種生物性逆境(biotic stress)具有耐性的植物及植物栽培品種，亦即該等植物展示對動物及微生物害蟲之更佳防禦，諸如抵抗線蟲、昆蟲、蟎、植物病原性真菌、細菌、病毒及/或類病毒。

【0146】 可藉由上文所揭示之方法處理的植物及植物栽培品種包括

對一或多種非生物性逆境(abiotic stress)具有耐性的彼等植物。非生物性逆境條件可包括例如乾旱、低溫暴露、熱暴露、滲透應力(osmotic stress)、水澇、增加之土壤鹽度、增加之礦物質暴露、臭氧暴露、高曝光、氮營養物質之有限可用性、磷營養物質之有限可用性、避蔭。

【0147】 可藉由上文所揭示之方法處理的植物及植物栽培品種包括由增強的產量特徵表徵之彼等植物。該等植物之產量增加可為例如經改良植物生理、生長及發育，諸如水利用效率、水保留效率、經改良氮使用、增強之碳同化、經改良光合成、增加之發芽效率及加快之成熟的結果。產量可另外受經改良植物株型影響(在逆境及非逆境條件下)，包括(但不限於)早期開花、對雜交種子產量之開花控制、幼苗活力、植物大小、節間數目及距離、根生長、種子大小、果實大小、豆莢大小、豆莢或穗數目、每個豆莢或穗之種子數目、種子質量、增強之種子填充、降低之種子散佈度、降低之豆莢開裂性及耐倒伏性。其他產量性狀包括種子組合物，諸如，碳水化合物含量及例如棉或澱粉之組合物、蛋白質含量、油含量及組合物、營養值、抗營養化合物之還原、經改良可加工性及更佳儲存穩定性。

【0148】 可藉由上文所揭示之方法處理的植物及植物栽培品種包括為雜交植物之植物及植物栽培品種，該等雜交植物已表現大體上引起較高產量、活力、健康及耐生物及非生物逆境之雜種優勢或雜交活力的特徵。

【0149】 可藉由上文所揭示之方法處理的植物及植物栽培品種(藉由諸如基因工程改造之植物生物技術方法獲得)包括為除草劑耐受性植物之植物及植物栽培品種，亦即對一或多種給定除草劑耐受的植物。此等植物可藉由基因轉型或藉由選擇含有賦予此除草劑耐受性之突變之植物來獲

得。

【0150】 可藉由上文所揭示之方法處理的植物及植物栽培品種(藉由諸如基因工程改造之植物生物技術方法獲得)包括為昆蟲耐性轉殖基因植物之植物及植物栽培品種，亦即對某些目標昆蟲之攻擊具有耐性的植物。此等植物可藉由基因轉型或藉由選擇含有賦予此昆蟲耐性之突變之植物來獲得。

【0151】 可藉由上文所揭示之方法處理的植物及植物栽培品種(藉由諸如基因工程改造之植物生物技術方法獲得)包括為耐病害轉殖基因植物之植物及植物栽培品種，亦即對某些目標昆蟲之攻擊具有耐性的植物。此等植物可藉由基因轉型或藉由選擇含有賦予此昆蟲耐性之突變之植物來獲得。

【0152】 可藉由上文所揭示之方法處理的植物及植物栽培品種(藉由諸如基因工程改造之植物生物技術獲得)包括對非生物逆境耐受之植物及植物栽培品種。此等植物可藉由基因轉型或藉由選擇含有賦予此逆境耐性之突變之植物來獲得。

【0153】 可藉由上文所揭示之方法處理的植物及植物栽培品種(藉由諸如基因工程改造之生物技術方法獲得)包括展示更改所收集產物之數量數目、品質及/或儲存穩定性及/或更改所收集產物之特定成分之特性的植物及植物栽培品種。

【0154】 可藉由上文所揭示之方法處理的植物及植物栽培品種(藉由諸如基因工程改造之植物生物技術方法獲得)包括具有經更改纖維特徵之植物及植物栽培品種(諸如，棉植物)。此等植物可藉由基因轉型或藉由選擇含有賦予此經更改纖維特徵之突變之植物來獲得。

【0155】 可藉由上文所揭示之方法處理的植物及植物栽培品種(藉由諸如基因工程改造之植物生物技術方法獲得)包括具有經更改油型態特徵之植物及植物栽培品種，諸如油菜或相關芸苔屬植物。此等植物可藉由基因轉型或藉由選擇含有賦予此等經更改油型態特徵之突變之植物來獲得。

【0156】 可藉由上文所揭示之方法處理的植物或植物栽培品種(可藉由諸如基因工程改造之植物生物技術方法獲得)包括具有經更改落粒性特徵之植物及植物栽培品種，諸如油菜或相關芸苔屬植物。此等植物可藉由基因轉型或藉由選擇含有賦予此等經更改落粒性特徵之突變之植物來獲得，且包括具有延時或經降低落粒性之植物，諸如油菜植物。

【0157】 可藉由上文所揭示之方法處理的植物及植物栽培品種(藉由諸如基因工程改造之植物生物技術方法獲得)包括具有經更改轉譯後蛋白質修飾模式之植物及植物栽培品種，諸如菸草植物。

【0158】 可根據以下實例來進一步理解本發明教示之態樣，該等實例不應視為以任何方式限制本發明教示之範疇。

【0159】

實例

合成式(I)化合物

【0160】

製備實例1：製備N-[(4,5-二氯-3-甲基-2-噻吩基)羰基]甘胺酸乙酯(化合物 I.03)

【0161】

步驟1：製備3-胺基-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯

將1.35 g (5.04 mmol)之3-乙醯胺基-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯溶解於

2.1 mL (25.18 mmol)之37% (w/w)鹽酸水溶液及8.2 mL之甲醇的混合物中。在75°C下加熱混合物3小時。在0°C下將經冷卻之反應混合物用30% (w/w)氫氧化鈉溶液處理。用乙酸乙酯萃取所得溶液。經合併之有機層經硫酸鎂乾燥，過濾且在減壓下濃縮，以得到按原樣用於下一步驟中的呈棕色固體狀之812 mg (純度98%，產率70%)之3-胺基-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯。LogP = 3.11。(M+H) = 226。

【0162】

步驟2：製備3-溴-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯

在0°C下，向763 mg (3.41 mmol)之溴化銅(II)及0.53 mL (純度90%，3.99 mmol)之亞硝酸第三丁酯於10.5 mL之無水乙腈中之溶液中分批添加600 mg (純度88%，2.33 mmol)之3-胺基-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯。在氣體釋放之後，在室溫下攪拌溶液18小時。反應混合物用乙酸乙酯稀釋且用1 M鹽酸水溶液酸化。用乙酸乙酯萃取水層三次。經合併之有機層經硫酸鎂乾燥，過濾且在減壓下濃縮。藉由矽膠管柱層析(梯度正庚烷/乙酸乙酯)純化殘餘物，以得到呈黃色固體狀之563 mg (純度98%，產率82%)之3-溴-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯。LogP = 3.99。(M+H) = 288。

【0163】

步驟3：製備3-溴-4,5-二氯噻吩-2-甲酸(化合物VIIIa.03)

向250 mg (0.86 mmol)之3-溴-4,5-二氯噻吩-2-甲酸甲酯於5 mL四氫呋喃中之溶液中逐滴添加1 mL之1.9 M氫氧化鉀水溶液(1.9 mmol)。在室溫下攪拌反應物18小時。反應混合物用乙酸乙酯、水及飽和碳酸氫鈉水溶液稀釋。有機層用飽和碳酸氫鈉水溶液洗滌兩次。經合併之水層在0°C下小心地用37% (w/w)鹽酸水溶液酸化且用乙酸乙酯萃取。經合併之有機層

經硫酸鎂乾燥，過濾且在減壓下濃縮，以得到呈白色固體狀之219 mg (純度96%，產率88%)之3-溴-4,5-二氯噻吩-2-甲酸。 $\text{LogP} = 2.51$ 。 $(\text{M}-\text{H}) = 273$ 。

【0164】

步驟4：製備*N*-[(3-溴-4,5-二氯-2-噻吩基)羰基]甘胺酸乙酯(化合物VIa.01)

在5 mL微波小瓶中在惰性氛圍下，將溶解於3 mL二氯甲烷中的157 mg (0.93 mmol)之2-氯-1,3-二甲基氯化咪唑啉之溶液添加在溶解於7 mL二氯甲烷中的197 mg (0.72 mmol)之3-溴-4,5-二氯噻吩-2-甲酸及0.54 mL (3.07 mmol)之*N,N*-二異丙基乙胺的溶液內。在攪拌5 min之後，添加200 mg (1.43 mmol)之甘胺酸乙酯鹽酸鹽(1:1)且在室溫下攪拌反應混合物20小時。反應混合物用水淬滅且用二氯甲烷萃取。經合併之有機層經硫酸鎂乾燥，過濾且在減壓下濃縮。藉由矽膠管柱層析(梯度正庚烷/乙酸乙酯)純化殘餘物，以得到呈白色固體狀之209 mg (純度100%，產率81%)之*N*-[(3-溴-4,5-二氯-2-噻吩基)羰基]甘胺酸乙酯。 $\text{LogP} = 3.33$ 。 $(\text{M}+\text{H}) = 360$ 。

【0165】

步驟5：製備*N*-[(4,5-二氯-3-甲基-2-噻吩基)羰基]甘胺酸乙酯(化合物I.03)

在5 mL微波小瓶中在惰性氛圍下，連續添加100 mg (0.27 mmol)之*N*-[(3-溴-4,5-二氯-2-噻吩基)羰基]甘胺酸乙酯、25 mg (0.41 mmol)之甲基硼酸、3.1 mg (0.01 mmol)之乙酸鈮(II)、7.8 mg (0.02 mmol)之三環己基膦及206 mg (0.96 mmol)之三元磷酸鉀，隨後添加經脫氣之甲苯(1.25 mL)及水(0.13 mL)。密封小瓶且在100°C下攪拌反應混合物18小時。反應

混合物用水稀釋且用二氯甲烷萃取。經合併之有機層經由Chem Elut™濾芯過濾且在減壓下濃縮。藉由製備型高效液相層析(梯度乙腈/甲酸(1%)水溶液)純化殘餘物，以得到呈白色固體狀之38 mg (純度100%，產率46%)之*N*-[(4,5-二氯-3-甲基-2-噻吩基)羰基]甘胺酸乙酯。LogP = 2.95。
(M+H) = 296。

【0166】

製備實例2：製備*N*-[(4,5-二溴-3-甲基-2-噻吩基)羰基]-纈胺酸乙酯(化合物I.04)

向溶解於3 mL四氫呋喃中的154 mg (0.50 mmol)之4,5-二溴-3-甲基噻吩-2-甲酸及183 mg (1.00 mmol)之DL-纈胺酸乙酯鹽酸鹽的溶液中添加0.21 mL (1.51 mmol)之三乙胺，隨後添加0.45 mL (0.75 mmol)之含50% (w/w)丙烷膦酸酐溶液之乙酸乙酯。在室溫下攪拌反應混合物2小時。反應混合物用飽和碳酸氫鈉水溶液淬滅且用乙酸乙酯萃取。經合併之有機層經硫酸鎂乾燥，過濾且在減壓下濃縮。藉由矽膠管柱層析(梯度正庚烷/乙酸乙酯)純化殘餘物，以得到呈白色固體狀之103 mg (純度95%，產率45%)之*N*-[(4,5-二溴-3-甲基-2-噻吩基)羰基]-纈胺酸乙酯。LogP = 4.32。
(M+H) = 426。

【0167】

製備實例3：製備*N*-[(4,5-二溴-3-甲基-2-噻吩基)羰基]-纈胺酸(化合物I.07)

向164 mg (0.38 mmol)之*N*-[(4,5-二溴-3-甲基-2-噻吩基)羰基]-纈胺酸乙酯於3 mL四氫呋喃中之溶液中逐滴添加0.81 mL之1 M氫氧化鋰溶液(0.81 mmol)。在室溫下攪拌反應物18小時。反應混合物用乙酸乙酯及飽

和碳酸氫鈉水溶液稀釋。有機層用飽和碳酸氫鈉水溶液洗滌兩次。經合併之水層在0℃下小心地用37% (w/w)鹽酸水溶液酸化且用乙酸乙酯萃取。經合併之有機層經硫酸鎂乾燥，過濾且在減壓下濃縮，以得到呈白色固體狀之151 mg (98%純度，96%產率)之*N*-[(4,5-二溴-3-甲基-2-噻吩基)羰基]-纈胺酸。LogP = 2.92。(M+H) = 398。

【0168】

製備實例4：製備1-{[(4,5-二溴-3-甲基-2-噻吩基)羰基]胺基}環丙烷甲酸乙酯(化合物I.01)

向200 mg (0.60 mmol)之1-{[(4-溴-3-甲基-2-噻吩基)羰基]胺基}環丙烷甲酸乙酯(化合物IXa.01)於6 mL無水N,N-二甲基甲醯胺中之溶液中添加129 mg (0.72 mmol)之N-溴代丁二醯亞胺。在50℃下攪拌反應物18小時。使反應混合物分配於乙酸乙酯與水之間且用乙酸乙酯萃取。經合併之有機層經由Chem Elut™濾芯過濾且在減壓下濃縮。藉由製備型高效液相層析(梯度乙腈/甲酸(1%)水溶液)純化殘餘物，以得到呈白色固體狀之148 mg (純度100%，產率60%)之1-{[(4,5-二溴-3-甲基-2-噻吩基)羰基]胺基}環丙烷甲酸乙酯。LogP = 3.22。(M+H) = 410。

【0169】

製備實例5：製備1-{[(4,5-二溴-3-甲基-2-噻吩基)羰基]胺基}環丙烷甲酸乙酯(化合物I.01)

【0170】

步驟1：製備1-[(4-溴-5-[(第三丁氧基羰基)胺基]-3-甲基-2-噻吩基)羰基]胺基]環丙烷甲酸乙酯(化合物XIa.01)

向溶解於1.4 mL二氯甲烷中的92 mg (0.27 mmol)之4-溴-5-[(第三丁

氧基羰基)胺基]-3-甲基噻吩-2-甲酸(化合物XIIIa.02)及67 mg (0.41 mmol)之1-胺基環丙烷甲酸乙酯鹽酸鹽的溶液中添加0.14 mL (0.82 mmol)之N,N-二異丙基乙胺，隨後添加 135 mg (0.35 mmol)之1-[雙(二甲基胺基)亞甲基]-1*H*-1,2,3-三唑并[4,5-*b*]吡錠3-氧化六氟磷酸鹽。在室溫下攪拌反應混合物3.5小時。反應混合物用水淬滅且用二氯甲烷萃取。經合併之有機層經由Chem Elut™濾芯過濾且在減壓下濃縮。藉由矽膠管柱層析(梯度庚烷/乙酸乙酯)純化殘餘物，以得到呈橙色固體狀之95 mg (純度93%，產率72%)之1-[(4-溴-5-[(第三丁氧基羰基)胺基]-3-甲基-2-噻吩基)羰基)胺基]環丙烷甲酸乙酯。LogP = 3.28。 (M+H) = 447。

【0171】

步驟2：製備1-[(5-胺基-4-溴-3-甲基-2-噻吩基)羰基)胺基]環丙烷甲酸乙酯(化合物Xa.01)

向60 mg (0.13 mmol)之1-[(第三丁氧基羰基)胺基]-3-甲基-2-噻吩基)羰基)胺基]環丙烷甲酸酯於0.60 mL氯仿中之溶液中添加0.62 mL三氟乙酸。在室溫下攪拌反應物18小時。用甲苯稀釋反應混合物且在減壓下濃縮。藉由製備型高效液相層析(梯度乙腈/乙酸銨(1 mM)水溶液)純化殘餘物，以得到呈白色固體狀之35 mg (純度100%，產率74%)之1-[(5-胺基-4-溴-3-甲基-2-噻吩基)羰基)胺基]環丙烷甲酸乙酯。LogP = 1.92。 (M+H) = 347。

【0172】

步驟3：製備1-[(4,5-二溴-3-甲基-2-噻吩基)羰基)胺基]環丙烷甲酸乙酯(化合物I.01)

在0°C下，向溴化銅(II) (28.9 mg，0.13 mmol)於0.5 mL無水乙腈中

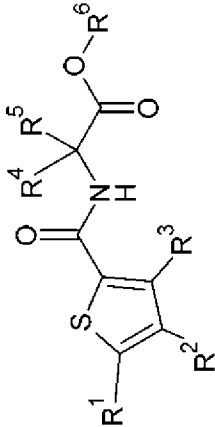
之溶液中逐滴添加亞硝酸第三丁酯(17 μL , 0.13 mmol)。在逐滴添加30 mg (0.08 mmol)之1-{[(5-胺基-4-溴-3-甲基-2-噻吩基)羰基]胺基}環丙烷甲酸乙酯於0.7 mL無水乙腈中的溶液之前使反應混合物升溫至室溫。在室溫下攪拌反應混合物2小時。反應混合物用乙酸乙酯稀釋且小心地用1 M鹽酸水溶液酸化。用乙酸乙酯萃取水層三次。經合併之有機層經硫酸鎂乾燥，過濾且在減壓下濃縮。藉由矽膠管柱層析(梯度正庚烷/乙酸乙酯)純化殘餘物，以得到呈白色固體狀之11 mg (純度100%，產率31%)之1-{[(4,5-二溴-3-甲基-2-噻吩基)羰基]胺基}環丙烷甲酸乙酯。LogP = 3.19。
(M+H) = 410。

【0173】

例示性化合物

如表I.1、I.2、I.3、I.4、I.5、I.6及I.7中所展示的根據本發明之例示性化合物類似於上文所提供之實例及/或根據本文中所揭示之方法之一般描述來製備。除非以不同方式指定，否則例示性化合物為外消旋的。

【0174】 下表I.1以非限制性方式說明根據式(I)之化合物之實例。



(I)

表I.1：

實例N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	LogP	鏡像異構體	旋光度*
I.01	Br	Br	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	3.19 ^[a]		
I.02	Br	Br	Me	H	H	Et	3.02 ^[a]		
I.03	Cl	Cl	Me	H	H	Et	2.90 ^[a]		
I.04	Br	Br	Me	異丙基	H	Et	4.32 ^[a]		
I.05	Br	Br	Me	2-甲基丙基	H	Et	4.56 ^[a]		
I.06	Br	Br	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		H	2.25 ^[a]		
I.07	Br	Br	Me	異丙基	H	H	2.92 ^[a]		
I.08	Br	Br	Me	丙-2-基	H	Et	4.32 ^[a]	(S)	+22.1° (c=0.99, CH ₂ Cl ₂ , 20°C)
I.09	Br	Br	Me	H	H	Me	2.64 ^[a]		
I.10	Br	Br	Me	H	H	H	2.05 ^[a]		
I.11	Br	Br	Me	丙-2-基	H	Me	3.87 ^[a]	(S)	+3.6° (c=1.13, MeOH, 25°C)
I.12	Br	Br	Me	異丙基	H	(Z)-己-3-烯-1-基	5.75 ^[a]		
I.13	Br	Br	Me	異丙基	H	丙-2-炔-1-基	4.06 ^[a]		
I.14	Br	Br	Me	異丙基	H	2-甲基丙基	5.22 ^[a]		
I.15	Br	Br	Me	異丙基	H	氨基甲基	3.69 ^[a]		
I.16	Br	Br	Me	異丙基	H	氧雜環丁-3-基	3.58 ^[a]		
I.17	Br	Br	Me	異丙基	H	硫雜環丁-3-基	4.67 ^[a]		
I.18	Br	Br	Me	異丙基	H	1,1-二氧雜硫雜環	3.42 ^[a]		

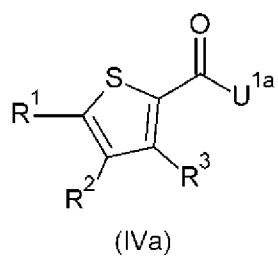
實例N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	LogP	鏡像異構體	旋光度*
I.19	Br	Br	Me	異丙基	H	丁-3-基	3.78 ^[a]		
I.20	Br	Br	Me	異丙基	H	氧雜環戊-3-基 三甲基矽烷基 基	5.78 ^[a]		
I.21	Br	Br	Me	Me	H	Et	3.39 ^[a]		
I.22	Br	Br	Me	丁-2-基	H	Me	4.30 ^[a]	(2S,3S)	
I.23	Br	Br	Me	(4-羥基苯基)甲基	H	Et	3.33 ^[a]		
I.24	Cl	Cl	Me	2-甲基氫硫基乙基	H	Et	3.94 ^[a]	(S)	+26.4° (c=1.06, CDCl ₃ , 25°C)
I.25	Cl	Cl	Me	異丙基	H	Et	4.23 ^[a]	(S)	+44.7° (c=1.08, CDCl ₃ , 25°C)
I.26	Cl	Cl	Me	苯甲基	H	Et	4.46 ^[a]	(S)	+91° (c=1.06, CDCl ₃ , 25°C)
I.27	Cl	Cl	Me	Me	H	Et	3.31 ^[a]		
I.28	Cl	Cl	Me	H	H	第三丁基	3.77 ^[a]		
I.29	Cl	Cl	Me	異丙基	H	Me	3.79 ^[a]	(S)	+40° (c=1, CDCl ₃ , 25°C)
I.30	Cl	Cl	Me	2-甲基氫硫基乙基	H	Me	3.55 ^[a]	(S)	+30.8° (c=1.04, CDCl ₃ , 25°C)
I.31	Cl	Cl	Me	H	H	Me	2.51 ^[a]		
I.32	Cl	Cl	Me	丁-2-基	H	Me	4.23 ^[a]	(2S,3S)	+46.9° (c=1.07, CDCl ₃ , 25°C)
I.33	Cl	Cl	Me	2-甲基丙基	H	Et	4.54 ^[a]	(S)	+29.4° (c=1.02, CDCl ₃ , 25°C)
I.34	Cl	Cl	Me	H	H	苯甲基	3.76 ^[a]		
I.35	Cl	Cl	Me	2-甲基氫硫基乙基	H	Me	3.55 ^[a]		
I.36	Cl	Cl	Me	2-甲基氫硫基乙基	H	Me	3.55 ^[a]	(R)	
I.37	Cl	Cl	Me	2-甲基丙基	H	Et	4.51 ^[a]		
I.38	Cl	Cl	Me	苯甲基	H	Et	4.46 ^[a]		
I.39	Cl	Cl	Me	(4-羥基苯基)甲基	H	Et	3.29 ^[a]		
I.40	Cl	Cl	Me	異丙基	H	Et	4.23 ^[a]		
I.41	Cl	Cl	Me	H	H	異丙基	3.29 ^[a]		
I.42	Cl	Cl	Me	Me	H	Et	3.31 ^[a]	(R)	
I.43	Cl	Cl	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	3.08 ^[a]		
I.44	Cl	Cl	Me	異丙基	H	Et	4.23 ^[a]	(R)	-48.4° (c=1.08, CDCl ₃ , 25°C)

實例N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	LogP	鏡像異構體	旋光度*
I.45	Cl	Cl	Me	苯甲基	H	Et	4.46 ^[a]	(R)	-91.2° (c=1.08, CDCl3, 25°C)
I.46	Cl	Cl	Me	異丙基	H	Me	3.79 ^[a]	(R)	
I.47	Cl	Cl	Me	2-甲基氫硫基乙基	H	Et	3.94 ^[a]		
I.48	Cl	Cl	Me	H	H	丙基	3.35 ^[a]		
I.49	Br	Br	Me	異丙基	H	異丙基	4.77 ^[a]		
I.50	Cl	Cl	Me	-CH ₂ -CH ₂ -	H	Me	2.75 ^[a]		
I.51	Cl	Cl	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		H	2.26 ^[a]		
I.52	Br	Br	Me	異丙基	H	環丙基甲基	4.80 ^[a]		
I.53	Br	Br	Me	異丙基	H	環丁基	4.98 ^[a]		
I.54	Br	Br	Me	異丙基	H	丙基	4.77 ^[a]		
I.55	Br	Br	Me	異丙基	H	丁基	5.25 ^[a]		
I.56	Br	Br	Me	異丙基	H	環丙基	4.37 ^[a]		
I.57	Br	Br	Me	異丙基	H	苯甲基	5.03 ^[a]		
I.58	Br	Br	Me	異丙基	H	烯丙基	4.46 ^[a]		
I.59	Br	Br	Me	異丙基	H	2,2,2-三氟乙基	4.51 ^[a]		
I.60	Br	Br	Me	異丙基	H	苯基	4.85 ^[a]		
I.61	Br	Br	Me	異丙基	H	第三丁基	5.25 ^[a]		
I.62	Br	Br	Me	丙-2-基	H	Et	4.37 ^[a]	(R)	-44.4° (c=1.04, CDCl3, 25°C)
I.63	Br	Br	Me	丙-2-基	H	Me	3.91 ^[a]	(R)	
I.64	Br	Br	Me	異丙基	H	Me	3.91 ^[a]		
I.65	Br	Br	Me	苯甲基	H	Et	4.59 ^[a]	(R)	-64.1° (c=1.41, CDCl3, 25°C)
I.66	Br	Br	Me	苯甲基	H	Et	4.59 ^[a]	(S)	+58° (c=1, CDCl3, 25°C)
I.67	Br	Br	Me	苯甲基	H	Et	4.59 ^[a]		
I.68	Br	Br	Me	2-甲基丙基	H	Et	4.66 ^[a]	(R)	-28° (c=1, CDCl3, 25°C)
I.69	Br	Br	Me	2-甲基丙基	H	Et	4.66 ^[a]	(S)	+26° (c=1, CDCl3, 25°C)
I.70	Br	Br	Me	2-甲基氫硫基乙基	H	Me	3.69 ^[a]	(R)	
I.71	Br	Br	Me	2-甲基氫硫基乙基	H	Me	3.69 ^[a]	(S)	+26° (c=1, CDCl3, 25°C)
I.72	Br	Br	Me	2-甲基氫硫基乙基	H	Me	3.69 ^[a]		

實例N°	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	LogP	鏡像異構體	旋光度*
I.73	Cl	Cl	Me	苯甲基	H	Me	4.12 ^[a]	(S)	
I.74	Cl	Cl	Me	2-甲基丙基	H	Et	4.59 ^[a]	(R)	
I.75	Cl	Cl	Me	苯基	H	Et	4.37 ^[a]		
I.76	Br	Br	Me	苯基	H	Et	4.44 ^[a]		
I.77	Br	Br	Me	H	H	噁烷-4-基	2.86 ^[a]		
I.78	Br	Br	Me	H	H	異丙基	3.40 ^[a]		
I.79	Br	Br	Me	Me	H	H	2.39 ^[a]		
I.80	Cl	Cl	Me	H	H	H	2.05 ^[a]		
I.81	Cl	Cl	Me	Me	H	H	2.28 ^[a]		
I.82	Cl	Cl	Me	異丙基	H	H	2.96 ^[a]		
I.83	Cl	Cl	Me	丁-2-基	H	H	3.31 ^[a]	(2S,3S)	+12.9° (c=1.4, DMSO, 25 °C)
I.84	Cl	Cl	Me	2-甲基丙基	H	H	3.31 ^[a]		
I.85	Cl	Cl	Me	2-甲基氫硫基乙基	H	H	2.80 ^[a]		
I.86	Cl	Cl	Me	苯甲基	H	H	3.31 ^[a]		
I.87	Br	Br	Me	2-甲基氫硫基乙基	H	H	2.89 ^[a]		
I.88	Br	Br	Me	苯甲基	H	H	3.30 ^[a]		
I.89	Br	Br	Me	丁-2-基	H	H	3.37 ^[a]	(2S,3S)	+14.3° (c=1.40, MeOH, 20 °C)
I.90	Br	Br	Me	2-甲基丙基	H	H	3.34 ^[a]		
I.91	Cl	Cl	Me	異丙基	H	Me	4.34 ^[a]		
I.92	Br	Br	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		Me	2.86 ^[a]		

註釋：Me：甲基，Et：乙基
*旋光度：濃度c以g/100 mL 表示

【0175】 下表I.2以非限制性方式說明根據式(IVa)之中間物之實例。

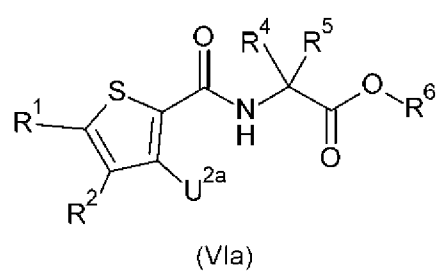


表I.2：

實例N°	R ¹	R ²	R ³	U ^{1a}	LogP
IVa.01	Br	Br	Me	2-甲基丙氧基	6.12 ^[a]
IVa.02	Cl	Cl	Me	OEt	4.80 ^[a]
IVa.03	Cl	Cl	Me	2-甲基丙氧基	6.05 ^[a]

註釋：Me：甲基，Et：乙基

【0176】 下表I.3以非限制性方式說明根據式(VIa)之中間物之實例。



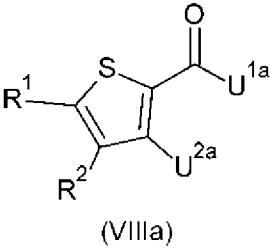
表I.3：

實例N°	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	U ^{2a}	LogP
VIa.01	Cl	Cl	H	H	Et	Br	3.33 ^[a]
VIa.02	Cl	Cl	H	H	Me	I	2.90 ^[a]
VIa.03	Br	Br	H	H	Me	I	2.96 ^[a]
VIa.04	Cl	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	Br	3.45 ^[a]
VIa.05	Cl	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	I	3.39 ^[a]
VIa.06	Cl	Cl	-CH ₂ -CH ₂ -		H	I	2.34 ^[a]
VIa.07	Br	Br	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	I	3.41 ^[a]
VIa.08	Br	Br	-CH ₂ -CH ₂ -		Me	I	3.06 ^[a]
VIa.09	Br	Br	-CH ₂ -CH ₂ -		H	I	2.43 ^[a]
VIa.10	Br	Br	H	H	Et	I	3.35 ^[a]
VIa.11	Br	Br	異丙基	H	Et	I	4.78 ^[a]
VIa.12	Cl	Cl	H	H	Et	I	3.31 ^[a]
VIa.13	Cl	Cl	H	H	H	I	2.21 ^[a]
VIa.14	Br	Br	苯甲基	H	Et	I	4.93 ^[a]
VIa.15	Br	Br	2-甲基丙基	H	Et	I	5.01 ^[a]

實例N°	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵	R ⁶	U ^{2a}	LogP
VIa.16	Br	Br	2-甲基氫硫基乙基	H	Et	I	4.37 ^[a]
VIa.17	Cl	Cl	異丙基	H	Et	Br	4.88 ^[a]
VIa.18	Cl	Cl	2-甲基丙基	H	Et	Br	5.17 ^[a]
VIa.19	Cl	Cl	2-甲基氫硫基乙基	H	Et	Br	4.46 ^[a]
VIa.20	Cl	Cl	苯甲基	H	Et	Br	5.01 ^[a]
VIa.21	Cl	Cl	異丙基	H	Et	I	4.85 ^[a]
VIa.22	Cl	Cl	2-甲基丙基	H	Et	I	5.08 ^[a]
VIa.23	Cl	Cl	2-甲基氫硫基乙基	H	Et	I	4.40 ^[a]
VIa.24	Cl	Cl	苯甲基	H	Et	I	5.00 ^[a]

註釋：Me：甲基，Et：乙基

【0177】 下表I.4以非限制性方式說明根據式(VIIIa)之中間物之實例。

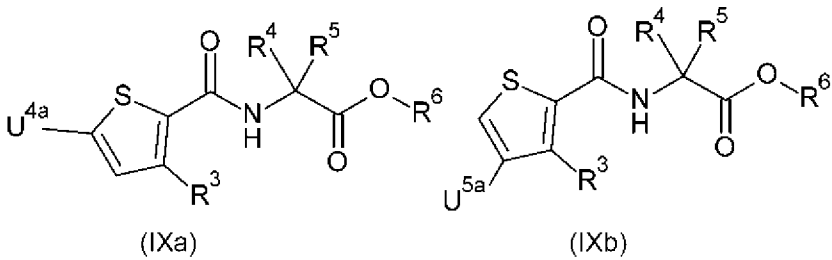


表I.4：

實例N°	R ¹	R ²	U ^{2a}	U ^{1a}	LogP
VIIIa.01	Cl	Cl	I	OEt	4.73 ^[b]
VIIIa.02	Cl	Cl	Br	OMe	4.11 ^[a]
VIIIa.03	Cl	Cl	Br	OH	2.52 ^[a]
VIIIa.04	Br	Br	I	OMe	4.20 ^[a]
VIIIa.05	Cl	Cl	I	OMe	4.15 ^[a]
VIIIa.06	Cl	Cl	I	OH	2.64 ^[a]
VIIIa.07	Br	Br	I	OEt	4.78 ^[a]
VIIIa.08	Cl	Cl	Br	OEt	4.58 ^[a]

註釋：Me：甲基，Et：乙基

【0178】 下表I.5以非限制性方式說明根據式(IXa)及(IXb)之中間物之實例。

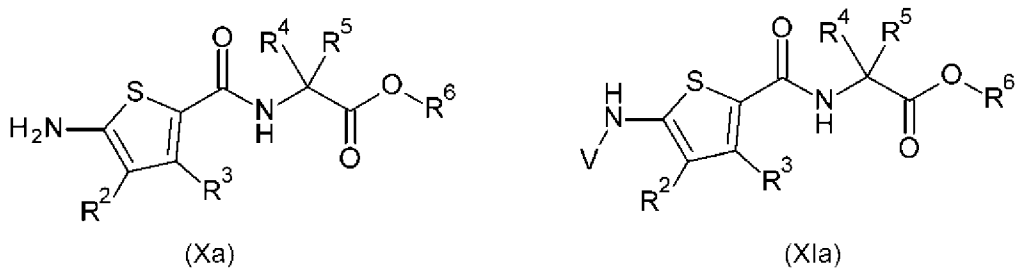


表I.5：

實例N°	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	U ^{4a}	U ^{5a}	LogP
IXa.01	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	Br		2.57 ^[a]
IXa.02	Me	H	H	Et	Br		2.39 ^[a]
IXa.03	Me	異丙基	H	Et	Br		3.65 ^[a]
IXa.04	Me	苯甲基	H	Et	Br		3.90 ^[a]
IXb.01	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		Et		Br	2.49 ^[a]

註釋：Me：甲基，Et：乙基

【0179】 下表I.6以非限制性方式說明根據式(Xa)及(XIa)之中間物之實例。

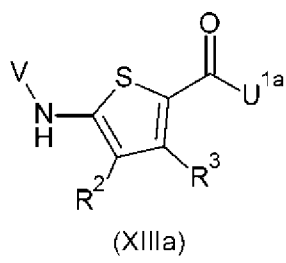


表I.6：

實例 N°	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	V	LogP
Xa.01	Br	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		Et		1.97 ^[a]
XIa.01	Br	Me	-CH ₂ -CH ₂ -		Et	第三丁氧基羰基	3.44 ^[b]

註釋：Me：甲基，Et：乙基

【0180】 下表I.7以非限制性方式說明根據式(XIIIa)之中間物之實例。



表I.7：

實例N°	R ²	R ³	U ^{1a}	V	LogP
XIIIa.01	Br	Me	OEt	第三丁氧基羰基	4.62 ^[a]
XIIIa.02	Br	Me	OH	第三丁氧基羰基	2.86 ^[a]

註釋：Me：甲基，Et：乙基

【0181】 在上表中，LogP值之量測根據EEC指令79/831 Annex V.A8藉由HPLC (高效液相層析)在反相管柱上用以下方法執行：

^[a] LogP值藉由在酸性範圍中用含0.1%甲酸之水及乙腈作為溶離劑(10%乙腈至95%乙腈之線性梯度)量測LC-UV來測定。

^[b] LogP值藉由在中性範圍中用含0.001莫耳乙酸銨溶液之水及乙腈作為溶離劑(10%乙腈至95%乙腈之線性梯度)量測LC-UV來測定。

^[c] LogP值藉由在酸性範圍中用0.1%磷酸及乙腈作為溶離劑(10%乙腈至95%乙腈之線性梯度)量測LC-UV來測定。

【0182】 若超過一個LogP值在相同方法中可用，則所有值均給出且由「+」分隔開。

【0183】 用具有已知LogP值之直鏈烷-2-酮(具有3至16個碳原子)進行校準(使用滯留時間及連續烷酮之間的線性插值量測LogP值)。使用200 nm至400 nm之UV光譜及層析信號之峰值來測定 λ 最大值。

【0184】

NMR峰清單

表A提供揭示於上表中之一些化合物之NMR資料(¹H)。

【0185】 所選實例之¹H-NMR資料以¹H-NMR峰清單之形式書寫。對於各信號峰，所列 δ 值以ppm表示且信號強度在圓括號中表示。 δ 值信號強度對之間為作為分隔符之分號或逗號。

【0186】 因此，實例之峰清單具有以下形式：

δ_1 (強度₁)； δ_2 (強度₂)；.....； δ_i (強度_i)；.....； δ_n (強度_n)

【0187】 在所印刷之NMR光譜實例中，尖銳信號之強度與信號高度

(cm)相關且展示信號強度之實際關係。自寬信號，可展示信號之若干峰值或中間值及其相較於光譜中之最密集信號之相對強度。

【0188】 為針對 ^1H 光譜校準化學位移，吾等使用四甲基矽烷及/或所用溶劑之化學位移，在DMSO中量測之光譜之情況下尤其如此。因此，在NMR峰清單中，四甲基矽烷峰可能出現但未必出現。

【0189】 ^1H -NMR峰清單類似於經典 ^1H -NMR印刷，且因此通常含有列於經典NMR解譯處之所有峰。

【0190】 此外，其可如古典 ^1H -NMR印刷一樣展示溶劑信號、目標化合物之立體異構體(其亦為本發明之目的)及/或雜質峰。

【0191】 為在溶劑及/或水之 δ 範圍(delta-range)中展示化合物信號，常用溶劑之峰(例如DMSO於DMSO- D_6 中之峰)及水之峰展示於吾等之 ^1H -NMR峰清單中且通常平均具有較高強度。

【0192】 目標化合物之立體異構體之峰及/或雜質峰通常平均具有比目標化合物(例如具有大於90%之純度)之峰更低的強度。

【0193】 此等立體異構體及/或雜質對於特定製備方法可為典型的。因此，其峰可經由「副產物指紋(side-products-fingerprint)」幫助識別吾等製備方法之再現。

【0194】 用已知方法(MestreC、ACD模擬以及用憑經驗評估之期望值)計算目標化合物之峰之專家可視情況使用額外強度過濾器按需要分離目標化合物之峰。此分離將類似於經典的 ^1H -NMR解譯處之相關峰挑選。

【0195】 具有峰清單之NMR資料描述的其他細節見於研究揭示資料庫第564025號之公開案「Citation of NMR Peaklist Data within Patent Applications」中。

表A：NMR峰清單

I.01: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2983 (5.4); 6.3048 (1.0); 4.2377 (1.2); 4.2139 (3.8); 4.1901 (3.8); 4.1664 (1.2); 2.5728 (16.0); 1.7079 (1.0); 1.6912 (2.9); 1.6804 (3.0); 1.6651 (1.3); 1.6024 (1.2); 1.3339 (1.3); 1.3188 (3.0); 1.3079 (3.1); 1.2970 (4.3); 1.2912 (1.6); 1.2732 (8.2); 1.2495 (3.9); 0.0356 (6.8)
I.02: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2987 (2.8); 6.3702 (0.5); 5.3358 (1.0); 4.3360 (1.1); 4.3122 (3.4); 4.2884 (3.5); 4.2646 (1.2); 4.2258 (4.6); 4.2093 (4.5); 2.5934 (16.0); 1.6227 (3.3); 1.3760 (4.2); 1.3522 (8.4); 1.3284 (4.0); 0.0353 (3.4)
I.03: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6720 (0.4); 8.6579 (0.9); 8.6436 (0.4); 4.1518 (1.3); 4.1340 (4.0); 4.1163 (4.0); 4.0985 (1.3); 3.9757 (3.9); 3.9610 (3.9); 3.3498 (56.9); 2.5264 (0.4); 2.5215 (0.6); 2.5129 (6.9); 2.5085 (13.6); 2.5040 (17.5); 2.4994 (12.6); 2.4949 (6.0); 2.4038 (16.0); 1.2386 (0.4); 1.2239 (4.5); 1.2061 (9.2); 1.1883 (4.4)
I.04: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5246 (2.1); 8.5091 (2.1); 4.2262 (2.0); 4.2121 (2.9); 4.2044 (0.6); 4.1971 (2.1); 4.1901 (1.4); 4.1827 (0.9); 4.1759 (1.4); 4.1684 (2.7); 4.1617 (0.5); 4.1542 (2.7); 4.1448 (0.9); 4.1400 (0.9); 4.1306 (2.7); 4.1231 (0.5); 4.1164 (2.7); 4.1089 (1.4); 4.1023 (0.9); 4.0947 (1.4); 4.0805 (0.4); 3.3228 (2.7); 2.5144 (1.0); 2.5109 (2.1); 2.5073 (2.8); 2.5037 (2.0); 2.5002 (0.9); 2.4121 (26.4); 2.1959 (0.3); 2.1822 (1.0); 2.1686 (1.8); 2.1550 (1.8); 2.1414 (1.1); 2.1278 (0.4); 1.2263 (7.8); 1.2120 (16.0); 1.1978 (7.7); 0.9722 (10.8); 0.9585 (11.5); 0.9537 (11.5); 0.9401 (10.5)
I.05: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2984 (1.5); 6.3390 (0.7); 6.3132 (0.9); 4.8070 (0.6); 4.7792 (1.2); 4.7623 (0.9); 4.7517 (0.7); 4.7355 (0.5); 4.2892 (1.4); 4.2654 (4.3); 4.2417 (4.4); 4.2179 (1.5); 2.5719 (4.2); 2.5621 (16.0); 1.7908 (0.9); 1.7725 (1.3); 1.7611 (1.3); 1.7538 (1.5); 1.7462 (1.9); 1.7253 (1.4); 1.7062 (0.9); 1.6863 (1.3); 1.6608 (1.0); 1.6564 (1.0); 1.6324 (0.7); 1.4570 (1.0); 1.3543 (5.0); 1.3305 (10.0); 1.3067 (5.1); 1.2917 (1.0); 1.2857 (1.0); 1.0435 (0.3); 1.0202 (6.9); 1.0065 (10.3); 0.9871 (6.6); 0.9283 (0.3); 0.9064 (0.7); 0.8832 (0.4); 0.0297 (0.4); 0.0254 (0.7)
I.06: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 12.4961 (2.0); 8.7878 (13.5); 3.3226 (11.2); 2.5437 (0.5); 2.5119 (15.4); 2.5084 (22.0); 2.5049 (17.8); 2.4800 (0.4); 2.4158 (70.6); 2.2841 (0.4); 2.0928 (6.3); 1.4392 (0.4); 1.4307 (0.4); 1.4239 (0.5); 1.4083 (5.6); 1.3989 (14.1); 1.3924 (16.0); 1.3839 (6.4); 1.3521 (0.6); 1.3056 (0.4); 1.2658 (0.7); 1.2420 (3.2); 1.2155 (0.4); 1.2021 (0.4); 1.1883 (0.6); 1.1763 (0.6); 1.1716 (0.8); 1.1622 (0.6); 1.1572 (1.2); 1.1482 (0.7); 1.1433 (0.7); 1.1222 (6.5); 1.1135 (14.8); 1.1070 (15.3); 1.0976 (5.6); 1.0670 (0.4); 0.8609 (0.5)
I.07: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 12.7425 (0.4); 8.3639 (2.1); 8.3478 (2.1); 4.2207 (2.0); 4.2080 (2.3); 4.2047 (2.2); 4.1920 (2.0); 3.5752 (2.1); 3.3269 (0.8); 2.5162 (1.6); 2.5125 (2.7); 2.5088 (3.6); 2.5052 (2.5); 2.5016 (1.1); 2.4179 (28.8); 2.2015 (0.3); 2.1880 (1.0); 2.1745 (1.6); 2.1612 (1.6); 2.1477 (1.0); 2.1342 (0.3); 0.9629 (16.0); 0.9494 (15.5)
I.08: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5386 (2.0); 8.5233 (2.0); 4.2147 (2.1); 4.2001 (3.4); 4.1854 (3.2); 4.1777 (1.0); 4.1709 (1.5); 4.1635 (2.7); 4.1567 (0.6); 4.1493 (2.7); 4.1398 (1.0); 4.1351 (1.0); 4.1257 (2.7); 4.1182 (0.6); 4.1115 (2.6); 4.1040 (1.4); 4.0973 (0.9); 4.0898 (1.3); 4.0756 (0.4); 3.3185 (58.2); 2.5358 (0.4); 2.5125 (2.9); 2.5090 (5.5); 2.5054 (7.2); 2.5018 (5.0); 2.4983 (2.3); 2.4080 (27.6); 2.1877 (0.4); 2.1741 (1.1); 2.1605 (1.8); 2.1469 (1.8); 2.1333 (1.1); 2.1197 (0.4); 1.2360 (0.5); 1.2208 (8.0); 1.2065 (16.0); 1.1923 (7.5); 0.9677 (11.8); 0.9540 (12.5); 0.9494 (11.9); 0.9357 (10.5)
I.09: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2988 (3.8); 6.3470 (0.4); 4.2461 (4.5); 4.2294 (4.4); 3.8469 (14.9); 2.5954 (16.0); 1.6069 (3.2); 0.0363 (4.7)

I.10: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 12.6968 (0.6); 8.5442 (2.2); 8.5326 (4.3); 8.5209 (2.3); 3.8971 (15.9); 3.8854 (16.0); 3.3973 (0.4); 3.3833 (0.6); 3.3296 (14.9); 2.5810 (0.5); 2.5466 (0.4); 2.5207 (9.4); 2.5166 (4.5); 2.5129 (8.3); 2.5093 (11.3); 2.5056 (8.3); 2.5020 (4.1); 2.4530 (64.6); 2.3213 (0.3)
I.11: ¹ H-NMR(400.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5820 (1.4); 8.5628 (1.4); 4.2506 (1.2); 4.2323 (2.1); 4.2141 (1.3); 3.6755 (16.0); 3.3300 (2.1); 2.5111 (1.7); 2.5071 (1.4); 2.4136 (15.3); 2.1826 (0.6); 2.1656 (1.1); 2.1486 (1.2); 2.1316 (0.7); 0.9701 (6.7); 0.9531 (7.3); 0.9458 (7.6); 0.9287 (6.8)
I.12: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2989 (1.9); 6.3630 (0.6); 6.3356 (0.6); 5.5734 (0.5); 5.5680 (0.4); 5.5618 (0.4); 5.5427 (0.5); 5.5375 (0.7); 5.5331 (0.4); 5.5134 (0.4); 5.3759 (0.4); 5.3567 (0.4); 5.3518 (0.7); 5.3465 (0.5); 5.3278 (0.4); 5.3216 (0.4); 5.3160 (0.5); 4.7510 (1.2); 4.7362 (1.2); 4.7229 (1.2); 4.7082 (1.2); 4.2548 (0.5); 4.2426 (0.9); 4.2197 (2.5); 4.1976 (2.5); 4.1753 (0.9); 4.1626 (0.5); 2.6800 (0.3); 2.5914 (16.0); 2.4882 (0.6); 2.4650 (1.6); 2.4419 (1.6); 2.4304 (0.4); 2.4199 (0.6); 2.3411 (0.4); 2.3347 (0.5); 2.3197 (0.5); 2.3116 (0.6); 2.2967 (0.6); 2.2887 (0.5); 2.2738 (0.5); 2.1186 (1.0); 2.1163 (1.0); 2.0919 (1.6); 2.0674 (1.1); 2.0652 (1.1); 1.0424 (6.3); 1.0322 (4.4); 1.0195 (6.3); 1.0066 (12.2); 0.9822 (9.5); 0.0339 (2.3)
I.13: ¹ H-NMR(499.9 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2615 (4.4); 6.2659 (0.6); 6.2495 (0.6); 4.8504 (1.1); 4.8456 (1.1); 4.8194 (1.9); 4.8146 (1.8); 4.7644 (1.3); 4.7552 (1.4); 4.7474 (1.4); 4.7382 (1.4); 4.7332 (2.0); 4.7283 (1.9); 4.7022 (1.1); 4.6973 (1.1); 2.5805 (0.5); 2.5592 (16.0); 2.5139 (1.6); 2.5090 (2.9); 2.5042 (1.4); 2.3363 (0.6); 2.3270 (0.6); 2.3225 (0.8); 2.3133 (0.8); 2.3088 (0.6); 2.2995 (0.5); 1.5613 (3.2); 1.0303 (6.9); 1.0166 (6.6); 0.9933 (6.8); 0.9796 (6.5); 0.0061 (0.4); -0.0002 (5.9)
I.14: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2990 (2.7); 6.3761 (0.5); 6.3487 (0.6); 4.7741 (1.2); 4.7593 (1.2); 4.7461 (1.2); 4.7313 (1.2); 4.0464 (0.3); 4.0242 (0.4); 4.0111 (2.2); 3.9996 (2.3); 3.9889 (2.3); 3.9779 (2.3); 3.9644 (0.4); 3.9426 (0.4); 2.5955 (16.0); 2.3537 (0.4); 2.3388 (0.5); 2.3307 (0.6); 2.3158 (0.6); 2.3078 (0.5); 2.2929 (0.5); 2.0557 (0.4); 2.0334 (0.8); 2.0111 (1.1); 1.9888 (0.9); 1.9665 (0.5); 1.6273 (0.4); 1.0542 (6.5); 1.0313 (6.3); 1.0153 (7.2); 1.0063 (13.8); 0.9923 (7.1); 0.9839 (13.1); 0.0350 (3.2)
I.15: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2991 (6.3); 6.1941 (0.5); 6.1676 (0.5); 4.9561 (1.9); 4.9041 (3.7); 4.8023 (1.6); 4.7985 (4.0); 4.7863 (1.3); 4.7747 (1.2); 4.7583 (1.2); 4.7465 (2.0); 2.5955 (16.0); 2.3810 (0.5); 2.3644 (0.5); 2.3581 (0.6); 2.3417 (0.6); 2.3353 (0.5); 2.3187 (0.5); 1.5948 (3.9); 1.1005 (6.3); 1.0776 (6.1); 1.0599 (6.4); 1.0369 (6.2); 0.0370 (8.1)
I.16: ¹ H-NMR(499.9 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2637 (2.6); 6.2129 (0.6); 6.1966 (0.7); 5.5218 (0.8); 5.5198 (0.8); 5.5092 (1.4); 5.4987 (0.8); 5.4966 (0.8); 5.4860 (0.3); 4.9335 (0.9); 4.9220 (1.8); 4.9203 (1.8); 4.9087 (1.8); 4.9072 (1.9); 4.8955 (0.9); 4.8944 (0.9); 4.7470 (1.3); 4.7378 (1.4); 4.7302 (1.3); 4.7210 (1.2); 4.7023 (1.0); 4.7010 (1.0); 4.6918 (1.0); 4.6904 (1.1); 4.6868 (1.0); 4.6856 (1.0); 4.6763 (0.8); 4.6751 (0.8); 4.6535 (1.0); 4.6525 (0.9); 4.6430 (1.0); 4.6418 (1.0); 4.6381 (1.0); 4.6368 (0.9); 4.6276 (0.8); 4.6264 (0.8); 2.5771 (0.4); 2.5532 (16.0); 2.3467 (0.5); 2.3373 (0.6); 2.3329 (0.7); 2.3236 (0.7); 2.3192 (0.6); 2.3099 (0.5); 1.1183 (0.4); 1.1051 (0.3); 1.0472 (6.5); 1.0335 (6.3); 1.0025 (6.6); 0.9887 (6.4); -0.0002 (2.6)

I.17: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2987 (1.9); 6.2581 (0.6); 6.2303 (0.6); 5.7442 (0.9); 5.7176 (1.5); 5.6914 (1.0); 4.7086 (1.2); 4.6935 (1.3); 4.6806 (1.2); 4.6654 (1.2); 3.6013 (0.9); 3.5733 (1.3); 3.5692 (1.2); 3.5538 (0.8); 3.5412 (1.1); 3.5216 (1.6); 3.4940 (1.2); 3.3963 (0.4); 3.3906 (0.9); 3.3852 (1.1); 3.3760 (0.9); 3.3706 (0.6); 3.3662 (1.3); 3.3591 (1.7); 3.3512 (1.3); 3.3420 (0.8); 3.3329 (0.8); 3.3298 (0.6); 3.3268 (0.6); 3.3213 (0.4); 2.6073 (0.4); 2.5850 (16.0); 2.3404 (0.5); 2.3250 (0.5); 2.3175 (0.7); 2.3022 (0.6); 2.2946 (0.5); 2.2793 (0.5); 1.0560 (6.4); 1.0331 (6.3); 1.0120 (6.6); 0.9890 (6.3); 0.0323 (2.0)
I.18: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2990 (5.6); 6.1603 (0.7); 6.1337 (0.7); 5.3964 (0.6); 5.3828 (0.8); 5.3705 (1.2); 5.3579 (0.8); 5.3445 (0.7); 5.3379 (0.7); 5.3329 (0.4); 4.7278 (1.2); 4.7115 (1.3); 4.7008 (1.2); 4.6845 (1.2); 4.6621 (1.3); 4.6520 (0.5); 4.6363 (1.3); 4.6257 (0.5); 4.6204 (0.7); 4.6100 (1.8); 4.5946 (0.6); 4.5841 (1.7); 4.3368 (0.6); 4.3244 (1.1); 4.3163 (0.6); 4.3125 (0.6); 4.3056 (0.4); 4.2846 (0.4); 4.2782 (0.4); 4.2720 (0.6); 4.2665 (0.4); 4.2594 (0.4); 4.2350 (0.5); 4.2278 (0.5); 4.2223 (0.9); 4.2096 (0.6); 4.1818 (0.5); 4.1771 (0.4); 4.1695 (0.8); 4.1576 (0.4); 2.6387 (0.3); 2.5896 (16.0); 2.3726 (0.5); 2.3563 (0.5); 2.3502 (0.7); 2.3336 (0.7); 2.3275 (0.6); 2.3107 (0.5); 1.6050 (3.6); 1.0994 (6.4); 1.0765 (6.2); 1.0514 (6.6); 1.0284 (6.4); 0.0360 (5.9)
I.19: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2984 (4.7); 6.3045 (0.7); 6.2825 (0.7); 5.4320 (0.8); 5.4246 (0.8); 5.4169 (1.2); 5.4116 (1.2); 5.4052 (0.8); 5.3966 (0.8); 4.7447 (1.2); 4.7298 (1.3); 4.7168 (1.2); 4.7019 (1.2); 3.9980 (1.1); 3.9833 (1.2); 3.9624 (3.6); 3.9472 (2.9); 3.9364 (1.9); 3.9166 (2.2); 3.9020 (1.0); 3.8785 (1.5); 3.8410 (0.6); 2.6112 (1.0); 2.5932 (16.0); 2.3510 (0.4); 2.3283 (0.7); 2.3227 (0.6); 2.3128 (0.6); 2.3070 (0.8); 2.2912 (0.8); 2.2847 (0.6); 2.2738 (0.8); 2.2633 (0.4); 2.2546 (0.6); 2.2457 (0.7); 2.2363 (0.4); 2.2282 (0.8); 2.2176 (0.4); 2.2082 (0.5); 2.2003 (0.4); 2.1286 (0.5); 2.1059 (0.3); 2.0819 (0.5); 2.0660 (0.6); 2.0421 (0.3); 1.1396 (0.5); 1.1356 (0.5); 1.1176 (0.6); 1.0578 (7.3); 1.0349 (7.1); 1.0149 (7.3); 0.9919 (7.0); 0.0343 (5.8)
I.20: ¹ H-NMR(499.9 MHz, CDCl ₃): δ= 7.1612 (2.7); 6.2456 (0.7); 6.2292 (0.7); 4.6155 (1.2); 4.6065 (1.3); 4.5987 (1.2); 4.5897 (1.2); 3.8048 (1.3); 3.7765 (3.7); 3.7478 (3.7); 3.7196 (1.3); 2.4560 (16.0); 2.1647 (0.5); 2.1556 (0.6); 2.1510 (0.7); 2.1419 (0.7); 2.1373 (0.6); 2.1281 (0.5); 1.4819 (1.1); 0.8965 (6.7); 0.8828 (6.5); 0.8665 (6.8); 0.8527 (6.5); 0.0062 (3.1); -0.0002 (47.4); -0.0068 (2.2); -0.1019 (3.3)
I.21: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6718 (0.9); 8.6545 (0.9); 8.3154 (0.7); 4.4049 (0.9); 4.3869 (1.4); 4.3689 (1.0); 4.1414 (0.6); 4.1346 (0.7); 4.1236 (2.1); 4.1170 (2.1); 4.1058 (2.2); 4.0993 (2.1); 4.0881 (0.8); 4.0816 (0.6); 3.3277 (9.2); 2.5207 (0.5); 2.5121 (5.4); 2.5077 (10.9); 2.5031 (14.3); 2.4985 (10.4); 2.4940 (5.1); 2.4192 (16.0); 1.3773 (6.7); 1.3590 (6.6); 1.2384 (0.6); 1.2116 (4.7); 1.1939 (9.7); 1.1761 (4.5); -0.0002 (2.1)
I.22: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5812 (1.1); 8.5623 (1.1); 8.3154 (1.4); 4.2932 (1.0); 4.2750 (1.8); 4.2569 (1.0); 3.6617 (16.0); 3.3265 (9.6); 3.3025 (0.6); 2.5069 (12.7); 2.5026 (16.6); 2.4982 (12.5); 2.3981 (15.4); 1.9313 (0.5); 1.9270 (0.4); 1.9208 (0.5); 1.9152 (0.6); 1.9098 (0.6); 1.8990 (0.5); 1.8927 (0.4); 1.4939 (0.3); 1.4831 (0.4); 1.4756 (0.4); 1.4602 (0.6); 1.4493 (0.5); 1.4415 (0.5); 1.4307 (0.5); 1.2860 (0.5); 1.2674 (0.7); 1.2461 (0.7); 1.2339 (0.7); 1.2119 (0.4); 0.8990 (6.5); 0.8817 (7.1); 0.8596 (6.7); 0.8409 (2.8); -0.0002 (1.9)

I.23: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2313 (3.1); 8.6161 (1.3); 8.5969 (1.3); 8.3148 (0.4); 7.0655 (3.6); 7.0444 (4.0); 6.6837 (0.5); 6.6767 (4.5); 6.6556 (4.1); 6.6487 (0.4); 4.4879 (0.4); 4.4746 (0.5); 4.4688 (0.6); 4.4629 (0.7); 4.4555 (0.6); 4.4497 (0.6); 4.4437 (0.6); 4.4304 (0.4); 4.1286 (0.8); 4.1257 (0.9); 4.1109 (2.6); 4.1081 (2.7); 4.0930 (2.8); 4.0905 (2.6); 4.0750 (1.0); 3.3321 (12.1); 3.0456 (0.6); 3.0325 (0.7); 3.0110 (1.1); 2.9980 (1.0); 2.9317 (1.1); 2.9063 (1.1); 2.8972 (0.7); 2.8717 (0.7); 2.5252 (0.4); 2.5203 (0.6); 2.5117 (8.5); 2.5073 (17.0); 2.5028 (22.1); 2.4982 (16.0); 2.4937 (7.7); 2.2707 (16.0); 1.2386 (0.5); 1.1761 (5.0); 1.1583 (10.4); 1.1406 (4.8); -0.0002 (3.3)
I.24: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6736 (0.8); 8.6549 (0.8); 8.3120 (1.2); 4.4937 (0.6); 4.4788 (0.6); 4.1601 (0.4); 4.1506 (0.6); 4.1423 (1.5); 4.1326 (1.6); 4.1245 (1.6); 4.1149 (1.5); 4.1064 (0.7); 4.0972 (0.4); 3.3267 (13.5); 3.3028 (0.4); 2.5808 (0.7); 2.5639 (0.9); 2.5578 (0.7); 2.5463 (0.7); 2.5378 (1.2); 2.5124 (6.7); 2.5079 (13.4); 2.5033 (17.5); 2.4987 (12.5); 2.4942 (6.1); 2.3832 (13.1); 2.0569 (16.0); 2.0468 (1.3); 2.0318 (0.8); 2.0268 (0.9); 2.0218 (0.5); 2.0130 (0.3); 2.0062 (0.4); 1.2188 (3.6); 1.2010 (7.6); 1.1833 (3.4); -0.0002 (1.6)
I.25: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5474 (0.8); 8.5281 (0.8); 8.3108 (0.3); 4.2166 (1.2); 4.1979 (1.6); 4.1898 (0.8); 4.1803 (1.6); 4.1721 (0.7); 4.1627 (1.6); 4.1451 (2.0); 4.1277 (2.0); 4.1101 (1.6); 4.1008 (0.7); 4.0924 (0.5); 4.0831 (0.7); 3.3279 (24.7); 2.5256 (0.4); 2.5209 (0.7); 2.5123 (8.8); 2.5079 (17.6); 2.5033 (23.1); 2.4987 (16.8); 2.4942 (8.2); 2.3701 (16.0); 2.1824 (0.6); 2.1653 (1.0); 2.1483 (1.0); 2.1312 (0.6); 1.2397 (0.5); 1.2244 (4.4); 1.2067 (9.0); 1.1889 (4.3); 0.9701 (6.1); 0.9520 (8.5); 0.9337 (5.7); -0.0002 (1.7)
I.26: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6908 (0.9); 8.6716 (1.0); 8.3114 (3.3); 7.3143 (0.4); 7.3005 (0.7); 7.2952 (2.7); 7.2865 (3.3); 7.2799 (10.4); 7.2695 (0.6); 7.2654 (0.8); 7.2379 (0.7); 7.2323 (0.8); 7.2226 (0.8); 7.2164 (0.9); 7.2080 (0.4); 7.2015 (0.4); 4.5934 (0.4); 4.5803 (0.5); 4.5741 (0.5); 4.5679 (0.6); 4.5610 (0.5); 4.5549 (0.5); 4.5486 (0.5); 4.5354 (0.4); 4.1404 (1.0); 4.1228 (3.3); 4.1052 (3.5); 4.0875 (1.2); 3.3323 (29.2); 3.3081 (1.3); 3.1845 (0.7); 3.1713 (0.7); 3.1501 (1.2); 3.1369 (1.0); 3.0625 (1.2); 3.0367 (1.2); 3.0282 (0.8); 3.0024 (0.7); 2.5259 (0.5); 2.5212 (0.8); 2.5126 (9.6); 2.5081 (19.2); 2.5035 (25.0); 2.4989 (18.0); 2.4944 (8.7); 2.2049 (16.0); 1.2393 (0.4); 1.1781 (4.6); 1.1604 (9.8); 1.1426 (4.5); -0.0002 (1.9)
I.27: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6725 (0.7); 8.6556 (0.7); 8.3103 (3.2); 4.4126 (0.8); 4.3946 (1.2); 4.3766 (0.8); 4.1439 (0.6); 4.1374 (0.7); 4.1261 (2.0); 4.1198 (2.0); 4.1083 (2.0); 4.1021 (2.0); 4.0906 (0.7); 4.0844 (0.6); 3.3335 (26.6); 3.3092 (1.4); 2.5262 (0.4); 2.5213 (0.6); 2.5128 (8.0); 2.5084 (15.6); 2.5038 (20.0); 2.4993 (14.3); 2.4948 (6.9); 2.3830 (16.0); 1.3841 (6.6); 1.3658 (6.6); 1.2396 (0.3); 1.2146 (4.4); 1.1968 (9.0); 1.1791 (4.3); -0.0002 (1.2)
I.28: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2614 (9.2); 6.3149 (1.0); 4.0958 (5.6); 4.0843 (5.5); 2.5044 (16.0); 1.5556 (11.5); 1.5030 (47.7); -0.0002 (4.5)
I.29: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5780 (0.8); 8.5588 (0.8); 8.3113 (0.6); 4.2438 (1.1); 4.2254 (1.7); 4.2071 (1.1); 3.6688 (16.0); 3.3268 (16.9); 2.5256 (0.4); 2.5208 (0.6); 2.5121 (8.0); 2.5077 (15.9); 2.5032 (20.6); 2.4986 (14.8); 2.4941 (7.2); 2.3703 (15.7); 2.1803 (0.5); 2.1632 (0.9); 2.1461 (1.0); 2.1291 (0.6); 1.2396 (0.4); 0.9656 (6.1); 0.9487 (6.1); 0.9403 (6.0); 0.9232 (5.6); -0.0002 (1.7)
I.30: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6808 (0.6); 8.6624 (0.7); 8.3101 (2.2); 4.5280 (0.5); 4.5140 (0.5); 3.6707 (12.6); 3.3296 (16.6); 3.3054 (0.9); 2.5788 (0.7); 2.5627 (0.8); 2.5605 (0.8); 2.5507 (0.6); 2.5448 (0.7); 2.5311 (1.2); 2.5264 (0.5); 2.5127 (7.3); 2.5083 (13.5); 2.5037 (17.2); 2.4991 (12.5); 2.4947 (6.0); 2.3847 (13.0); 2.0697 (0.6); 2.0662 (0.5); 2.0549 (16.0); 2.0466 (0.9); 2.0367 (0.8); 2.0303 (0.8); 2.0246 (0.5); 2.0178 (0.3); 2.0094 (0.4); -0.0002 (1.3)

I.31: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6854 (0.5); 8.6711 (1.0); 8.6571 (0.5); 3.9968 (4.2); 3.9822 (4.2); 3.6650 (15.9); 3.3779 (94.9); 2.5282 (0.4); 2.5234 (0.5); 2.5148 (6.6); 2.5105 (13.2); 2.5060 (17.3); 2.5016 (12.8); 2.4973 (6.5); 2.4053 (16.0); -0.0002 (0.5)
I.32: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5931 (0.9); 8.5741 (0.9); 4.2961 (1.1); 4.2779 (1.9); 4.2596 (1.1); 3.6636 (16.0); 3.3571 (87.2); 2.5264 (0.4); 2.5217 (0.8); 2.5130 (9.0); 2.5087 (17.6); 2.5042 (22.6); 2.4996 (16.2); 2.4951 (7.8); 2.3625 (15.7); 1.9388 (0.4); 1.9341 (0.4); 1.9281 (0.4); 1.9226 (0.4); 1.9168 (0.5); 1.9108 (0.4); 1.9062 (0.4); 1.4875 (0.3); 1.4797 (0.4); 1.4689 (0.4); 1.4644 (0.5); 1.4537 (0.5); 1.4457 (0.5); 1.4350 (0.4); 1.2889 (0.5); 1.2704 (0.7); 1.2542 (0.6); 1.2486 (0.8); 1.2367 (1.1); 1.2147 (0.4); 0.9019 (6.1); 0.8847 (6.3); 0.8805 (3.8); 0.8617 (6.3); 0.8431 (2.6)
I.33: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6403 (1.0); 8.6209 (1.0); 4.4022 (0.4); 4.3909 (0.6); 4.3830 (0.5); 4.3768 (0.6); 4.3718 (0.7); 4.3647 (0.6); 4.3578 (0.5); 4.3454 (0.5); 4.1580 (0.4); 4.1488 (0.6); 4.1400 (0.5); 4.1370 (0.7); 4.1310 (1.8); 4.1193 (1.9); 4.1132 (1.9); 4.1016 (1.8); 4.0954 (0.7); 4.0927 (0.5); 4.0839 (0.6); 4.0746 (0.4); 3.3276 (22.3); 2.5256 (0.5); 2.5120 (9.8); 2.5079 (18.5); 2.5034 (23.5); 2.4989 (16.9); 2.4945 (8.1); 2.3741 (16.0); 1.7675 (0.3); 1.7556 (0.5); 1.7409 (0.4); 1.7350 (0.5); 1.7289 (0.6); 1.7237 (0.7); 1.6986 (0.8); 1.6871 (0.5); 1.6708 (0.5); 1.6666 (0.5); 1.6540 (0.5); 1.5904 (0.7); 1.5780 (0.5); 1.5687 (0.5); 1.5575 (0.9); 1.5464 (0.5); 1.5365 (0.4); 1.2396 (0.5); 1.2126 (4.5); 1.1949 (9.2); 1.1771 (4.3); 0.9290 (5.8); 0.9130 (5.5); 0.8934 (5.6); 0.8774 (5.5); -0.0002 (1.6)
I.34: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6967 (0.7); 8.3111 (5.2); 7.3868 (4.2); 7.3838 (2.7); 7.3755 (11.1); 7.3660 (1.0); 7.3570 (1.2); 7.3488 (1.0); 7.3437 (0.6); 7.3355 (0.8); 5.1644 (8.1); 4.0530 (1.8); 4.0439 (1.9); 3.3322 (22.9); 3.3081 (1.6); 2.5258 (0.4); 2.5210 (0.7); 2.5125 (7.8); 2.5080 (15.4); 2.5034 (19.9); 2.4987 (14.3); 2.4942 (6.8); 2.3883 (16.0); -0.0002 (1.6)
I.35: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6811 (0.8); 8.6624 (0.8); 8.3098 (1.3); 4.5482 (0.3); 4.5332 (0.4); 4.5281 (0.6); 4.5136 (0.6); 4.5087 (0.5); 4.4937 (0.3); 3.6706 (12.7); 3.3308 (24.4); 3.3071 (0.6); 2.5787 (0.7); 2.5626 (0.8); 2.5606 (0.8); 2.5507 (0.7); 2.5448 (0.8); 2.5311 (1.3); 2.5266 (0.6); 2.5127 (7.6); 2.5083 (14.0); 2.5038 (18.0); 2.4992 (13.3); 2.4949 (6.5); 2.3847 (13.1); 2.0694 (0.6); 2.0663 (0.6); 2.0549 (16.0); 2.0366 (0.9); 2.0302 (0.9); 2.0245 (0.5); 2.0179 (0.4); 2.0093 (0.4); -0.0002 (1.1)
I.36: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6905 (0.7); 8.6725 (0.7); 4.5269 (0.5); 4.5119 (0.5); 3.6693 (12.7); 3.3460 (49.0); 2.5791 (0.7); 2.5629 (0.8); 2.5608 (0.8); 2.5511 (0.6); 2.5448 (0.7); 2.5315 (1.2); 2.5260 (0.5); 2.5124 (7.7); 2.5080 (14.1); 2.5034 (18.2); 2.4988 (13.4); 2.4944 (6.4); 2.3833 (13.0); 2.0680 (0.6); 2.0646 (0.6); 2.0542 (16.0); 2.0448 (0.9); 2.0351 (0.8); 2.0285 (0.8); 2.0229 (0.5); 2.0163 (0.4); 2.0078 (0.4); 1.2386 (0.4); -0.0002 (0.4)
I.37: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6536 (0.9); 8.6345 (1.0); 4.4017 (0.4); 4.3903 (0.5); 4.3824 (0.4); 4.3761 (0.5); 4.3711 (0.6); 4.3639 (0.5); 4.3570 (0.4); 4.3448 (0.5); 4.1578 (0.4); 4.1486 (0.5); 4.1399 (0.5); 4.1369 (0.7); 4.1308 (1.8); 4.1192 (1.9); 4.1130 (1.9); 4.1015 (1.8); 4.0952 (0.7); 4.0924 (0.5); 4.0838 (0.6); 4.0745 (0.4); 3.3596 (80.0); 2.5271 (0.4); 2.5223 (0.6); 2.5137 (8.1); 2.5092 (16.2); 2.5046 (21.0); 2.5000 (15.2); 2.4955 (7.4); 2.3732 (16.0); 1.7672 (0.3); 1.7554 (0.4); 1.7408 (0.4); 1.7349 (0.4); 1.7288 (0.6); 1.7234 (0.7); 1.6978 (0.8); 1.6850 (0.4); 1.6808 (0.4); 1.6686 (0.4); 1.6641 (0.4); 1.6518 (0.4); 1.6480 (0.4); 1.5908 (0.7); 1.5784 (0.5); 1.5689 (0.4); 1.5580 (0.8); 1.5468 (0.5); 1.5368 (0.4); 1.2391 (0.5); 1.2101 (4.5); 1.1923 (9.3); 1.1746 (4.3); 0.9281 (5.5); 0.9121 (5.2); 0.8920 (5.2); 0.8760 (5.2)

I.38: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6900 (1.0); 8.6708 (1.0); 8.3115 (1.5); 7.3142 (0.4); 7.2950 (2.7); 7.2864 (3.3); 7.2799 (10.4); 7.2693 (0.6); 7.2654 (0.8); 7.2378 (0.7); 7.2321 (0.8); 7.2226 (0.8); 7.2162 (0.9); 7.2080 (0.4); 7.2014 (0.4); 4.5933 (0.4); 4.5803 (0.5); 4.5740 (0.5); 4.5678 (0.7); 4.5608 (0.6); 4.5547 (0.6); 4.5484 (0.6); 4.5352 (0.4); 4.1405 (1.0); 4.1229 (3.3); 4.1053 (3.5); 4.0875 (1.2); 3.3295 (22.9); 3.3055 (0.6); 3.1844 (0.7); 3.1712 (0.7); 3.1499 (1.2); 3.1369 (1.0); 3.0624 (1.2); 3.0367 (1.2); 3.0281 (0.8); 3.0024 (0.7); 2.5257 (0.5); 2.5209 (0.8); 2.5123 (10.1); 2.5079 (19.9); 2.5034 (25.7); 2.4988 (18.5); 2.4943 (8.9); 2.2050 (16.0); 1.2397 (0.4); 1.1782 (4.6); 1.1605 (9.6); 1.1427 (4.4); -0.0002 (1.9)
I.39: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.2514 (2.6); 8.6265 (1.2); 8.6072 (1.3); 7.0685 (3.3); 7.0473 (3.6); 6.6844 (0.5); 6.6774 (4.2); 6.6727 (1.3); 6.6610 (1.2); 6.6562 (3.9); 6.6491 (0.4); 4.4934 (0.4); 4.4802 (0.5); 4.4742 (0.5); 4.4684 (0.6); 4.4610 (0.6); 4.4551 (0.5); 4.4491 (0.6); 4.4358 (0.4); 4.1303 (0.7); 4.1273 (0.8); 4.1125 (2.3); 4.1096 (2.4); 4.0947 (2.5); 4.0920 (2.3); 4.0767 (0.9); 3.3686 (95.7); 3.3653 (83.9); 3.3630 (90.8); 3.0518 (0.6); 3.0386 (0.6); 3.0172 (1.0); 3.0041 (0.9); 2.9377 (1.0); 2.9124 (1.0); 2.9032 (0.7); 2.8779 (0.6); 2.5268 (0.7); 2.5219 (1.1); 2.5135 (14.1); 2.5090 (28.2); 2.5044 (36.7); 2.4998 (26.4); 2.4953 (12.7); 2.2313 (16.0); 1.2389 (0.6); 1.1761 (4.7); 1.1584 (10.0); 1.1406 (4.5); -0.0002 (2.0)
I.40: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5609 (0.8); 8.5416 (0.8); 4.2142 (1.2); 4.1967 (1.6); 4.1954 (1.6); 4.1894 (0.8); 4.1779 (1.3); 4.1716 (0.7); 4.1623 (1.6); 4.1446 (2.0); 4.1272 (2.1); 4.1095 (1.6); 4.1002 (0.7); 4.0918 (0.5); 4.0824 (0.7); 3.3649 (92.0); 2.5272 (0.4); 2.5222 (0.7); 2.5138 (8.6); 2.5093 (17.2); 2.5047 (22.3); 2.5001 (16.0); 2.4956 (7.6); 2.3690 (16.0); 2.1804 (0.5); 2.1634 (0.9); 2.1463 (0.9); 2.1293 (0.6); 1.2387 (0.6); 1.2217 (4.5); 1.2040 (9.3); 1.1862 (4.4); 0.9695 (5.9); 0.9522 (7.3); 0.9500 (7.0); 0.9326 (5.5)
I.41: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6430 (0.4); 8.6288 (0.8); 8.6146 (0.4); 8.3108 (1.2); 4.9724 (0.4); 4.9567 (1.1); 4.9411 (1.5); 4.9255 (1.1); 4.9099 (0.4); 3.9385 (3.3); 3.9240 (3.3); 3.3286 (18.1); 3.3045 (0.5); 2.5261 (0.4); 2.5212 (0.6); 2.5126 (7.2); 2.5082 (14.4); 2.5037 (18.6); 2.4991 (13.4); 2.4947 (6.5); 2.4037 (16.0); 1.2153 (15.9); 1.1996 (15.7); -0.0002 (1.4)
I.42: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6724 (0.8); 8.6551 (0.8); 8.3108 (0.7); 4.4126 (1.0); 4.3946 (1.6); 4.3766 (1.0); 4.1439 (0.6); 4.1374 (0.7); 4.1261 (2.0); 4.1198 (2.0); 4.1083 (2.0); 4.1021 (2.0); 4.0905 (0.7); 4.0844 (0.6); 3.3317 (29.5); 3.3081 (0.3); 2.5260 (0.4); 2.5127 (7.7); 2.5083 (15.0); 2.5037 (19.4); 2.4991 (14.0); 2.4947 (6.8); 2.3830 (16.0); 1.3839 (6.5); 1.3657 (6.4); 1.2144 (4.3); 1.1967 (8.9); 1.1789 (4.2); -0.0002 (1.3)
I.43: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.9195 (2.0); 4.0933 (1.3); 4.0756 (4.2); 4.0579 (4.2); 4.0401 (1.3); 3.3493 (68.1); 2.5263 (0.4); 2.5215 (0.6); 2.5128 (7.5); 2.5084 (15.0); 2.5038 (19.5); 2.4992 (14.1); 2.4947 (6.8); 2.3689 (16.0); 1.4425 (1.1); 1.4304 (2.9); 1.4221 (3.1); 1.4112 (1.3); 1.2388 (0.3); 1.1749 (1.5); 1.1689 (4.9); 1.1641 (3.3); 1.1556 (3.4); 1.1513 (9.6); 1.1436 (1.3); 1.1335 (4.3); -0.0002 (1.1)
I.44: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5590 (0.9); 8.5399 (0.9); 4.2145 (1.2); 4.1967 (1.8); 4.1894 (0.8); 4.1783 (1.4); 4.1715 (0.7); 4.1622 (1.6); 4.1446 (2.0); 4.1271 (2.0); 4.1095 (1.6); 4.1002 (0.7); 4.0918 (0.5); 4.0824 (0.7); 3.3452 (65.9); 2.5258 (0.5); 2.5124 (9.5); 2.5080 (18.5); 2.5034 (23.6); 2.4988 (16.9); 2.4944 (8.1); 2.3691 (16.0); 2.1803 (0.6); 2.1633 (1.0); 2.1462 (1.0); 2.1292 (0.6); 1.2390 (0.5); 1.2216 (4.5); 1.2038 (9.1); 1.1861 (4.3); 0.9695 (6.3); 0.9521 (8.1); 0.9326 (5.8); -0.0002 (1.2)

I.45: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.7008 (1.4); 8.6815 (1.4); 7.3164 (0.6); 7.2970 (3.2); 7.2872 (4.4); 7.2816 (11.0); 7.2667 (1.0); 7.2400 (0.8); 7.2346 (1.0); 7.2253 (1.0); 7.2186 (1.1); 7.2102 (0.6); 7.2034 (0.5); 4.5939 (0.5); 4.5806 (0.7); 4.5746 (0.7); 4.5684 (0.8); 4.5614 (0.7); 4.5551 (0.7); 4.5490 (0.7); 4.5358 (0.5); 4.1390 (1.2); 4.1214 (3.7); 4.1037 (3.8); 4.0860 (1.3); 3.3510 (98.3); 3.1844 (0.8); 3.1713 (0.8); 3.1501 (1.3); 3.1371 (1.2); 3.0614 (1.3); 3.0356 (1.3); 3.0271 (0.9); 3.0013 (0.8); 2.5081 (23.1); 2.5037 (28.5); 2.4993 (20.7); 2.2039 (16.0); 1.2383 (0.7); 1.1746 (4.7); 1.1568 (9.5); 1.1391 (4.5); -0.0002 (0.7)
I.46: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5881 (0.8); 8.5689 (0.8); 4.2420 (1.1); 4.2241 (1.6); 4.2053 (1.1); 3.6681 (16.0); 3.3468 (61.3); 2.5260 (0.4); 2.5213 (0.5); 2.5126 (7.2); 2.5081 (14.4); 2.5035 (18.7); 2.4989 (13.4); 2.4944 (6.4); 2.3693 (15.6); 2.1785 (0.5); 2.1613 (0.9); 2.1443 (0.9); 2.1272 (0.6); 1.2390 (0.4); 0.9649 (5.8); 0.9479 (5.8); 0.9390 (5.6); 0.9220 (5.3); -0.0002 (0.9)
I.47: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6834 (0.8); 8.6646 (0.8); 4.5130 (0.3); 4.4978 (0.4); 4.4931 (0.6); 4.4781 (0.6); 4.4738 (0.5); 4.4584 (0.3); 4.1593 (0.4); 4.1497 (0.6); 4.1415 (1.5); 4.1317 (1.6); 4.1237 (1.6); 4.1140 (1.5); 4.1056 (0.6); 4.0963 (0.4); 3.3489 (62.0); 2.5813 (0.6); 2.5646 (0.8); 2.5580 (0.6); 2.5468 (0.6); 2.5381 (1.2); 2.5258 (0.5); 2.5128 (7.1); 2.5083 (14.3); 2.5037 (18.8); 2.4990 (13.4); 2.4945 (6.4); 2.3820 (13.0); 2.0563 (16.0); 2.0458 (1.2); 2.0420 (0.8); 2.0308 (0.8); 2.0257 (0.9); 2.0205 (0.5); 2.0118 (0.3); 2.0050 (0.4); 1.2388 (0.4); 1.2161 (3.6); 1.1984 (7.6); 1.1807 (3.4); -0.0002 (0.9)
I.48: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6674 (1.4); 8.6559 (2.3); 8.6444 (1.1); 4.0600 (5.2); 4.0468 (10.0); 4.0337 (5.0); 3.9915 (8.4); 3.9798 (8.1); 3.7102 (7.3); 3.3215 (9.0); 3.1463 (13.6); 2.5364 (0.4); 2.5114 (2.7); 2.5079 (3.3); 2.5044 (2.4); 2.4418 (7.3); 2.4083 (30.6); 1.6384 (0.9); 1.6239 (2.7); 1.6103 (5.0); 1.5957 (5.0); 1.5821 (2.5); 1.5677 (0.6); 0.9091 (8.4); 0.8943 (16.0); 0.8794 (7.2)
I.49: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.4923 (0.3); 7.2989 (3.9); 6.3916 (0.5); 6.3644 (0.6); 5.1699 (0.4); 5.1490 (1.0); 5.1282 (1.4); 5.1073 (1.0); 5.0864 (0.4); 4.7153 (1.2); 4.7009 (1.3); 4.6875 (1.2); 4.6730 (1.2); 2.6476 (1.2); 2.5976 (16.0); 2.4411 (0.9); 2.3587 (1.0); 2.3402 (0.5); 2.3256 (0.5); 2.3172 (0.7); 2.3026 (0.7); 2.2943 (0.5); 2.2797 (0.5); 1.6249 (0.8); 1.3363 (7.6); 1.3316 (8.1); 1.3153 (7.7); 1.3108 (8.1); 1.0442 (6.6); 1.0213 (6.5); 1.0071 (6.8); 0.9841 (6.5); 0.0359 (4.1)
I.50: ¹ H-NMR(300.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.9269 (2.0); 3.6346 (16.0); 3.3469 (6.1); 2.5345 (0.6); 2.5286 (1.2); 2.5225 (1.7); 2.5165 (1.2); 2.5106 (0.6); 2.3931 (15.8); 1.4833 (1.0); 1.4668 (2.6); 1.4557 (3.0); 1.4414 (1.3); 1.2147 (1.4); 1.2003 (2.9); 1.1892 (2.7); 1.1726 (1.0); 0.0193 (1.2)
I.51: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.7996 (2.3); 2.8919 (0.8); 2.7333 (0.7); 2.7322 (0.7); 2.5210 (0.4); 2.5125 (4.1); 2.5081 (8.4); 2.5035 (11.0); 2.4989 (7.9); 2.4944 (3.8); 2.3887 (1.7); 2.3706 (16.0); 1.4114 (1.1); 1.3996 (2.7); 1.3914 (2.9); 1.3807 (1.3); 1.3753 (0.8); 1.3568 (0.6); 1.1254 (1.3); 1.1147 (2.8); 1.1065 (2.8); 1.0946 (1.0); -0.0002 (7.8)
I.52: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2604 (9.4); 6.3394 (1.0); 6.3189 (1.0); 4.7313 (1.4); 4.7205 (1.4); 4.7103 (1.4); 4.6995 (1.3); 4.0842 (1.0); 4.0656 (1.2); 4.0560 (1.9); 4.0374 (1.8); 3.9951 (1.8); 3.9769 (1.8); 3.9669 (1.0); 3.9485 (0.9); 2.5620 (16.0); 2.5133 (0.8); 2.3211 (0.6); 2.3042 (0.9); 2.2925 (0.9); 2.2754 (0.7); 1.5420 (6.0); 1.1955 (0.4); 1.1832 (0.7); 1.1754 (0.7); 1.1640 (1.1); 1.1521 (0.8); 1.1448 (1.1); 1.1272 (0.6); 1.0202 (7.9); 1.0029 (8.0); 0.9934 (8.3); 0.9760 (7.7); 0.9527 (0.5); 0.6225 (0.8); 0.6097 (3.0); 0.5900 (2.9); 0.5778 (0.8); 0.3245 (1.1); 0.3128 (3.3); 0.3008 (3.1); 0.2885 (0.8); -0.0002 (9.8)

I.53: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2594 (9.0); 6.3038 (0.9); 6.2837 (0.9); 5.0683 (1.1); 5.0498 (1.6); 5.0313 (1.1); 4.6842 (1.3); 4.6733 (1.4); 4.6633 (1.3); 4.6524 (1.3); 2.5560 (16.0); 2.3975 (1.2); 2.3796 (1.4); 2.3660 (1.3); 2.3489 (0.7); 2.3056 (0.7); 2.2938 (0.7); 2.2887 (0.9); 2.2770 (0.9); 2.2718 (0.8); 2.2601 (0.6); 2.1539 (0.7); 2.1338 (0.9); 2.1293 (0.9); 2.1108 (1.0); 2.0925 (0.9); 2.0861 (0.9); 2.0614 (0.6); 1.8789 (0.4); 1.8527 (0.9); 1.8269 (0.9); 1.8018 (0.3); 1.6862 (0.6); 1.6655 (1.0); 1.6396 (0.9); 1.6187 (0.4); 1.5406 (7.5); 1.0083 (7.6); 0.9912 (7.7); 0.9728 (7.8); 0.9555 (7.3); -0.0002 (9.5)
I.54: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.3486 (0.6); 7.2595 (9.4); 6.3215 (1.0); 6.3020 (1.0); 4.7145 (1.4); 4.7036 (1.4); 4.6942 (1.4); 4.6833 (1.3); 4.2074 (0.3); 4.1913 (0.9); 4.1739 (0.9); 4.1635 (1.2); 4.1475 (3.3); 4.1308 (3.3); 4.1149 (1.2); 4.1047 (0.6); 3.4468 (0.3); 3.4310 (0.4); 2.5587 (16.0); 2.5143 (1.7); 2.3009 (0.7); 2.2843 (1.0); 2.2724 (1.0); 2.2552 (0.7); 1.7407 (0.6); 1.7247 (1.7); 1.7073 (3.2); 1.6898 (3.2); 1.6721 (1.7); 1.6535 (0.4); 1.5408 (6.9); 1.1159 (0.9); 1.0986 (0.9); 1.0107 (8.1); 0.9933 (8.5); 0.9875 (6.5); 0.9749 (9.2); 0.9687 (10.0); 0.9583 (8.6); 0.9492 (5.6); 0.9293 (1.8); 0.9107 (0.5); -0.0002 (9.7); -0.0016 (9.7)
I.55: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2596 (8.2); 6.3204 (0.9); 6.3002 (0.9); 4.7089 (1.4); 4.6979 (1.4); 4.6880 (1.3); 4.6769 (1.3); 4.2144 (0.6); 4.2044 (1.2); 4.1879 (3.2); 4.1715 (3.2); 4.1554 (1.1); 4.1449 (0.5); 2.5843 (0.7); 2.5583 (16.0); 2.2961 (0.6); 2.2792 (0.9); 2.2675 (0.9); 2.2504 (0.6); 1.6899 (0.5); 1.6739 (1.6); 1.6532 (2.2); 1.6359 (2.0); 1.6192 (0.8); 1.5483 (2.3); 1.4477 (0.4); 1.4294 (1.4); 1.4108 (2.4); 1.3918 (2.3); 1.3732 (1.3); 1.3551 (0.3); 1.2491 (0.5); 1.2322 (0.5); 1.0085 (7.7); 0.9913 (7.6); 0.9712 (8.4); 0.9662 (6.2); 0.9540 (8.3); 0.9471 (8.9); 0.9285 (3.7); -0.0002 (8.6)
I.56: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2595 (8.6); 6.2836 (1.1); 6.2640 (1.1); 4.6642 (1.4); 4.6531 (1.5); 4.6435 (1.4); 4.6322 (1.4); 4.2198 (1.1); 4.2102 (1.4); 4.1985 (1.0); 4.1893 (0.4); 2.5737 (0.6); 2.5578 (16.0); 2.2586 (0.7); 2.2413 (1.0); 2.2270 (1.0); 2.2122 (0.7); 1.5416 (4.5); 1.0866 (0.4); 1.0705 (0.3); 0.9966 (7.9); 0.9795 (7.7); 0.9540 (7.9); 0.9368 (7.6); 0.7910 (0.9); 0.7732 (3.7); 0.7574 (6.2); 0.7336 (1.8); -0.0002 (9.0)
I.57: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.3962 (0.5); 7.3643 (13.9); 7.3411 (0.8); 7.3280 (0.3); 7.2583 (9.0); 6.2948 (1.0); 6.2743 (1.0); 5.2567 (1.6); 5.2264 (3.5); 5.1808 (3.5); 5.1505 (1.5); 4.7627 (1.3); 4.7516 (1.4); 4.7417 (1.3); 4.7305 (1.3); 2.5374 (16.0); 2.3031 (0.6); 2.2859 (0.9); 2.2743 (0.9); 2.2689 (0.8); 2.2575 (0.6); 1.5387 (6.1); 0.9786 (7.4); 0.9614 (7.2); 0.9198 (7.5); 0.9026 (7.2); -0.0002 (9.5)
I.58: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2593 (8.8); 6.2970 (1.0); 6.2770 (1.0); 5.9603 (0.6); 5.9466 (0.6); 5.9330 (0.9); 5.9176 (1.0); 5.9037 (0.6); 5.8914 (0.7); 5.8768 (0.4); 5.3842 (2.0); 5.3414 (1.7); 5.2997 (2.1); 5.2737 (1.9); 4.7448 (1.4); 4.7338 (1.5); 4.7238 (1.8); 4.7126 (1.6); 4.6907 (1.9); 4.6732 (3.1); 4.6573 (1.7); 4.6395 (0.4); 4.6249 (0.4); 2.5760 (0.7); 2.5570 (16.0); 2.3172 (0.7); 2.3005 (1.0); 2.2862 (1.0); 2.2711 (0.7); 1.5410 (5.1); 1.1011 (0.4); 1.0846 (0.5); 1.0155 (7.8); 0.9985 (7.7); 0.9767 (7.9); 0.9594 (7.6); -0.0002 (9.0)
I.59: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2986 (11.6); 6.2315 (0.4); 6.2038 (0.5); 4.8488 (1.2); 4.8334 (1.2); 4.8206 (1.2); 4.8053 (1.3); 4.7793 (0.8); 4.7649 (0.4); 4.7516 (0.8); 4.7372 (1.0); 4.7095 (1.0); 4.6818 (0.4); 4.5314 (0.3); 4.5037 (1.0); 4.4760 (1.1); 4.4616 (0.8); 4.4483 (0.4); 4.4339 (0.8); 2.9948 (0.7); 2.9227 (0.6); 2.9210 (0.6); 2.5940 (16.0); 2.3853 (0.4); 2.3698 (0.4); 2.3624 (0.6); 2.3469 (0.6); 2.3396 (0.5); 2.3239 (0.4); 1.5881 (7.6); 1.0855 (6.1); 1.0627 (5.9); 1.0411 (6.2); 1.0181 (6.0); 0.0484 (0.4); 0.0376 (12.4); 0.0284 (0.4); 0.0267 (0.5)

I.60: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.4710 (1.0); 7.4693 (1.1); 7.4629 (0.5); 7.4448 (2.5); 7.4231 (0.9); 7.4177 (2.0); 7.3292 (1.1); 7.3254 (0.6); 7.3102 (0.6); 7.3046 (1.6); 7.2981 (4.8); 7.2833 (0.4); 7.2798 (0.5); 7.1597 (2.2); 7.1558 (2.9); 7.1487 (0.7); 7.1309 (2.2); 7.1277 (1.8); 6.3872 (0.6); 6.3590 (0.6); 5.0168 (1.2); 5.0017 (1.3); 4.9888 (1.2); 4.9736 (1.2); 2.6094 (16.0); 2.5512 (0.4); 2.5359 (0.5); 2.5282 (0.6); 2.5130 (0.6); 2.5054 (0.5); 2.4901 (0.5); 2.0430 (0.4); 1.5985 (1.6); 1.1772 (6.2); 1.1538 (10.8); 1.1296 (6.0); 0.0381 (5.3)
I.61: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2987 (0.6); 4.6463 (0.5); 4.6324 (0.5); 4.6188 (0.5); 4.6049 (0.5); 2.5964 (6.0); 1.5260 (16.0); 1.0332 (2.4); 1.0101 (2.5); 1.0044 (2.7); 0.9813 (2.3); 0.0320 (0.7)
I.62: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5464 (1.0); 8.5272 (1.0); 4.2137 (1.1); 4.2053 (0.3); 4.1950 (1.6); 4.1876 (0.8); 4.1777 (1.6); 4.1698 (0.8); 4.1605 (1.7); 4.1428 (2.2); 4.1253 (2.2); 4.1076 (1.7); 4.0983 (0.8); 4.0899 (0.5); 4.0806 (0.7); 3.3247 (9.9); 2.5119 (4.5); 2.5074 (9.4); 2.5028 (12.4); 2.4982 (8.8); 2.4937 (4.2); 2.4047 (16.0); 2.1760 (0.5); 2.1590 (1.0); 2.1420 (1.0); 2.1250 (0.6); 1.2215 (4.8); 1.2038 (9.9); 1.1860 (4.6); 0.9661 (6.2); 0.9485 (9.7); 0.9305 (5.7); -0.0002 (7.1)
I.63: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5741 (0.9); 8.5548 (0.9); 4.2417 (1.0); 4.2235 (1.6); 4.2051 (1.1); 3.6668 (16.0); 3.3250 (9.2); 2.5120 (3.8); 2.5075 (7.9); 2.5030 (10.4); 2.4983 (7.4); 2.4938 (3.5); 2.4052 (15.2); 2.1743 (0.5); 2.1572 (0.9); 2.1401 (0.9); 2.1231 (0.6); 0.9616 (5.9); 0.9446 (6.1); 0.9372 (5.8); 0.9202 (5.4); -0.0002 (6.8)
I.64: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5740 (0.9); 8.5547 (0.9); 4.2421 (1.1); 4.2240 (1.6); 4.2055 (1.1); 3.6671 (16.0); 3.3246 (6.8); 2.5121 (3.6); 2.5076 (7.4); 2.5030 (9.7); 2.4984 (6.9); 2.4939 (3.2); 2.4054 (15.3); 2.1745 (0.5); 2.1574 (0.9); 2.1404 (1.0); 2.1233 (0.6); 1.2382 (0.4); 0.9617 (6.1); 0.9448 (6.2); 0.9374 (6.0); 0.9203 (5.5); -0.0002 (7.1)
I.65: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6889 (1.4); 8.6696 (1.4); 7.3148 (0.6); 7.2956 (3.1); 7.2857 (4.2); 7.2801 (10.8); 7.2688 (0.9); 7.2650 (1.1); 7.2381 (0.8); 7.2328 (1.0); 7.2236 (1.0); 7.2167 (1.1); 7.2083 (0.6); 7.2016 (0.5); 4.5907 (0.5); 4.5775 (0.6); 4.5713 (0.6); 4.5652 (0.8); 4.5583 (0.7); 4.5520 (0.7); 4.5458 (0.7); 4.5326 (0.5); 4.1380 (1.2); 4.1205 (3.8); 4.1028 (3.9); 4.0850 (1.3); 3.3278 (8.7); 3.1798 (0.7); 3.1668 (0.8); 3.1455 (1.3); 3.1324 (1.2); 3.0573 (1.3); 3.0315 (1.3); 3.0230 (0.9); 2.9972 (0.8); 2.5117 (5.2); 2.5075 (10.1); 2.5030 (12.9); 2.4985 (9.3); 2.4943 (4.5); 2.2451 (16.0); 1.2380 (0.3); 1.1750 (4.9); 1.1573 (10.1); 1.1395 (4.7); -0.0002 (7.1)
I.66: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6890 (1.4); 8.6696 (1.4); 7.3172 (0.4); 7.3148 (0.6); 7.3010 (0.9); 7.2959 (3.0); 7.2858 (3.9); 7.2800 (10.6); 7.2688 (0.8); 7.2648 (1.0); 7.2382 (0.8); 7.2329 (0.9); 7.2238 (0.9); 7.2167 (1.0); 7.2083 (0.6); 7.2015 (0.5); 4.5903 (0.5); 4.5771 (0.6); 4.5709 (0.6); 4.5648 (0.7); 4.5579 (0.6); 4.5516 (0.6); 4.5454 (0.6); 4.5322 (0.5); 4.1379 (1.1); 4.1204 (3.7); 4.1027 (3.9); 4.0849 (1.3); 3.3277 (9.7); 3.1797 (0.7); 3.1665 (0.8); 3.1453 (1.2); 3.1322 (1.1); 3.0570 (1.2); 3.0312 (1.2); 3.0227 (0.8); 2.9969 (0.7); 2.5205 (0.4); 2.5120 (5.3); 2.5076 (10.5); 2.5030 (13.7); 2.4984 (9.7); 2.4939 (4.6); 2.2451 (16.0); 1.2379 (0.3); 1.1750 (5.1); 1.1573 (10.6); 1.1395 (4.9); -0.0002 (8.7)

I.67: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6895 (1.3); 8.6701 (1.3); 7.3174 (0.4); 7.3148 (0.6); 7.3012 (0.8); 7.2961 (2.8); 7.2945 (2.6); 7.2859 (3.6); 7.2801 (9.9); 7.2689 (0.7); 7.2647 (1.0); 7.2383 (0.8); 7.2331 (0.9); 7.2240 (0.8); 7.2168 (1.0); 7.2083 (0.6); 7.2016 (0.5); 4.5901 (0.4); 4.5769 (0.6); 4.5707 (0.6); 4.5645 (0.7); 4.5576 (0.6); 4.5513 (0.6); 4.5451 (0.6); 4.5319 (0.5); 4.1375 (1.1); 4.1200 (3.5); 4.1025 (3.8); 4.0847 (1.3); 3.3276 (10.1); 3.1794 (0.7); 3.1662 (0.8); 3.1450 (1.2); 3.1319 (1.0); 3.0567 (1.2); 3.0309 (1.2); 3.0224 (0.8); 2.9966 (0.7); 2.5206 (0.4); 2.5120 (5.0); 2.5075 (10.4); 2.5029 (13.8); 2.4983 (9.8); 2.4937 (4.7); 2.2448 (16.0); 1.1746 (5.2); 1.1569 (11.0); 1.1391 (5.0); 0.0080 (0.3); -0.0002 (9.7)
I.68: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6356 (1.1); 8.6165 (1.1); 4.3980 (0.3); 4.3867 (0.5); 4.3787 (0.4); 4.3725 (0.5); 4.3675 (0.6); 4.3604 (0.5); 4.3535 (0.4); 4.3412 (0.4); 4.1565 (0.4); 4.1473 (0.6); 4.1387 (0.5); 4.1352 (0.7); 4.1296 (1.9); 4.1175 (2.0); 4.1117 (2.0); 4.0998 (1.9); 4.0939 (0.7); 4.0906 (0.5); 4.0821 (0.6); 4.0728 (0.4); 3.3259 (11.2); 2.5125 (4.5); 2.5080 (9.2); 2.5035 (12.0); 2.4988 (8.5); 2.4943 (4.0); 2.4106 (16.0); 2.2451 (0.4); 1.7486 (0.4); 1.7339 (0.4); 1.7281 (0.4); 1.7220 (0.6); 1.7166 (0.7); 1.6962 (0.6); 1.6911 (0.6); 1.6845 (0.5); 1.6683 (0.5); 1.6641 (0.5); 1.6517 (0.4); 1.6479 (0.4); 1.5861 (0.6); 1.5736 (0.4); 1.5645 (0.5); 1.5534 (0.8); 1.5422 (0.5); 1.5325 (0.3); 1.2381 (0.5); 1.2104 (4.6); 1.1926 (9.7); 1.1749 (4.5); 0.9266 (5.5); 0.9106 (5.3); 0.8916 (5.2); 0.8756 (5.1); -0.0002 (6.0)
I.69: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6361 (1.1); 8.6169 (1.1); 4.3976 (0.4); 4.3864 (0.6); 4.3785 (0.5); 4.3723 (0.6); 4.3673 (0.7); 4.3601 (0.6); 4.3533 (0.4); 4.3409 (0.5); 4.1564 (0.4); 4.1472 (0.6); 4.1385 (0.5); 4.1350 (0.8); 4.1294 (1.9); 4.1174 (2.0); 4.1116 (2.0); 4.0997 (1.9); 4.0938 (0.7); 4.0904 (0.5); 4.0820 (0.6); 4.0726 (0.4); 3.3262 (12.2); 2.5124 (5.0); 2.5079 (10.0); 2.5034 (13.0); 2.4988 (9.2); 2.4943 (4.3); 2.4104 (16.0); 1.7603 (0.3); 1.7484 (0.4); 1.7337 (0.4); 1.7279 (0.4); 1.7217 (0.7); 1.7164 (0.7); 1.6910 (0.6); 1.6843 (0.6); 1.6681 (0.5); 1.6638 (0.5); 1.6514 (0.4); 1.6477 (0.4); 1.5860 (0.6); 1.5735 (0.4); 1.5643 (0.5); 1.5533 (0.9); 1.5420 (0.5); 1.5324 (0.4); 1.2384 (0.4); 1.2101 (4.7); 1.1924 (9.7); 1.1746 (4.5); 0.9264 (5.7); 0.9105 (5.4); 0.8915 (5.4); 0.8755 (5.3); -0.0002 (5.1)
I.70: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6774 (0.9); 8.6585 (0.9); 4.5419 (0.3); 4.5273 (0.4); 4.5216 (0.6); 4.5075 (0.6); 4.5021 (0.5); 4.4873 (0.3); 3.6684 (12.4); 3.3256 (8.1); 2.5763 (0.7); 2.5602 (0.8); 2.5580 (0.8); 2.5496 (0.6); 2.5421 (0.6); 2.5299 (1.1); 2.5207 (0.4); 2.5120 (4.2); 2.5076 (7.7); 2.5030 (9.9); 2.4984 (7.2); 2.4939 (3.4); 2.4207 (12.4); 2.0538 (16.0); 2.0441 (1.2); 2.0390 (0.8); 2.0297 (0.8); 2.0229 (0.8); 2.0173 (0.5); 2.0109 (0.3); 2.0021 (0.4); -0.0002 (6.5)
I.71: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6773 (0.8); 8.6585 (0.8); 4.5421 (0.3); 4.5275 (0.4); 4.5218 (0.6); 4.5073 (0.6); 4.5023 (0.5); 4.4875 (0.3); 3.6686 (12.3); 3.3254 (6.8); 2.5765 (0.7); 2.5604 (0.8); 2.5582 (0.8); 2.5499 (0.6); 2.5423 (0.6); 2.5302 (1.1); 2.5207 (0.4); 2.5121 (3.8); 2.5077 (6.9); 2.5031 (9.0); 2.4985 (6.6); 2.4940 (3.1); 2.4208 (12.4); 2.0540 (16.0); 2.0444 (1.2); 2.0392 (0.8); 2.0299 (0.8); 2.0232 (0.8); 2.0175 (0.5); 2.0111 (0.3); 2.0024 (0.4); -0.0002 (6.4)
I.72: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6773 (0.9); 8.6585 (0.9); 4.5422 (0.4); 4.5275 (0.4); 4.5219 (0.6); 4.5075 (0.6); 4.5024 (0.5); 4.4876 (0.4); 3.6687 (12.3); 3.3252 (6.8); 2.5765 (0.7); 2.5603 (0.8); 2.5582 (0.8); 2.5499 (0.6); 2.5423 (0.6); 2.5302 (1.2); 2.5121 (4.0); 2.5077 (7.3); 2.5031 (9.4); 2.4985 (6.9); 2.4940 (3.3); 2.4209 (12.5); 2.0540 (16.0); 2.0445 (1.3); 2.0393 (0.8); 2.0300 (0.8); 2.0233 (0.8); 2.0176 (0.5); 2.0112 (0.4); 2.0025 (0.4); 1.2384 (0.3); -0.0002 (6.7)

I.73: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6973 (1.1); 8.6777 (1.1); 7.3172 (0.3); 7.3146 (0.5); 7.3010 (0.6); 7.2958 (2.6); 7.2946 (2.5); 7.2865 (3.3); 7.2802 (9.7); 7.2696 (0.6); 7.2654 (0.9); 7.2365 (0.7); 7.2310 (0.8); 7.2214 (0.7); 7.2149 (0.9); 7.2117 (0.5); 7.2065 (0.5); 7.1999 (0.4); 4.6336 (0.4); 4.6213 (0.5); 4.6140 (0.5); 4.6073 (0.6); 4.6017 (0.6); 4.5950 (0.5); 4.5877 (0.6); 4.5753 (0.4); 3.6676 (16.0); 3.3296 (11.4); 3.2021 (0.7); 3.1898 (0.7); 3.1677 (1.1); 3.1554 (1.0); 3.0565 (1.1); 3.0301 (1.1); 3.0221 (0.8); 2.9957 (0.7); 2.5121 (3.9); 2.5076 (8.2); 2.5030 (10.8); 2.4984 (7.7); 2.4939 (3.7); 2.1967 (15.4); -0.0002 (6.7)
I.74: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.6444 (1.0); 8.6252 (1.0); 4.4023 (0.4); 4.3909 (0.5); 4.3830 (0.4); 4.3769 (0.5); 4.3719 (0.6); 4.3647 (0.5); 4.3577 (0.4); 4.3454 (0.4); 4.1579 (0.4); 4.1487 (0.5); 4.1400 (0.5); 4.1371 (0.7); 4.1309 (1.8); 4.1194 (1.9); 4.1131 (1.9); 4.1017 (1.8); 4.0953 (0.7); 4.0927 (0.6); 4.0840 (0.6); 4.0747 (0.4); 3.3277 (25.7); 2.5204 (0.5); 2.5119 (6.1); 2.5074 (12.8); 2.5029 (17.2); 2.4983 (12.8); 2.4938 (6.4); 2.3735 (16.0); 1.7554 (0.4); 1.7407 (0.4); 1.7350 (0.4); 1.7289 (0.6); 1.7234 (0.7); 1.6980 (0.8); 1.6861 (0.5); 1.6822 (0.4); 1.6696 (0.5); 1.6654 (0.5); 1.6530 (0.4); 1.6490 (0.4); 1.5908 (0.6); 1.5785 (0.5); 1.5691 (0.4); 1.5580 (0.8); 1.5469 (0.5); 1.5370 (0.4); 1.2393 (0.4); 1.2108 (4.4); 1.1930 (9.1); 1.1753 (4.2); 0.9281 (5.5); 0.9121 (5.3); 0.8924 (5.2); 0.8764 (5.2); -0.0002 (7.9)
I.75: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.4618 (0.5); 7.4535 (0.9); 7.4487 (0.7); 7.4404 (1.6); 7.4274 (4.3); 7.4159 (1.2); 7.4097 (3.3); 7.4075 (3.3); 7.4003 (1.1); 7.3918 (1.7); 7.3836 (2.3); 7.3776 (1.2); 7.3640 (0.8); 7.2981 (0.5); 6.9778 (0.7); 6.9559 (0.7); 5.7106 (2.2); 5.6880 (2.2); 4.3311 (0.6); 4.3191 (0.5); 4.3073 (0.6); 4.2953 (1.4); 4.2713 (1.8); 4.2469 (1.8); 4.2230 (1.4); 4.2109 (0.6); 4.1993 (0.5); 4.1872 (0.6); 2.5318 (16.0); 1.2899 (4.2); 1.2661 (8.5); 1.2423 (4.1); 0.0395 (0.5)
I.76: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.4610 (0.5); 7.4526 (0.8); 7.4484 (0.7); 7.4396 (1.7); 7.4266 (4.5); 7.4191 (1.4); 7.4158 (1.4); 7.4097 (3.4); 7.4075 (3.2); 7.4001 (1.2); 7.3921 (1.8); 7.3838 (2.2); 7.3644 (0.8); 7.2980 (0.6); 6.9659 (0.7); 6.9439 (0.7); 5.7084 (2.2); 5.6858 (2.2); 4.3301 (0.6); 4.3182 (0.5); 4.3063 (0.7); 4.2943 (1.4); 4.2703 (1.8); 4.2460 (1.8); 4.2221 (1.4); 4.2100 (0.6); 4.1984 (0.5); 4.1862 (0.6); 2.5863 (16.0); 1.2899 (4.2); 1.2661 (8.4); 1.2423 (4.0); 0.0392 (0.6)
I.77: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2631 (10.2); 6.2910 (1.2); 5.0930 (0.4); 5.0824 (0.7); 5.0715 (1.0); 5.0609 (1.4); 5.0504 (1.0); 5.0388 (0.7); 5.0302 (0.3); 4.2055 (5.5); 4.1933 (5.4); 3.9529 (1.2); 3.9418 (2.2); 3.9248 (1.7); 3.9121 (2.5); 3.9010 (1.4); 3.5810 (1.5); 3.5745 (1.7); 3.5517 (2.8); 3.5288 (1.4); 3.5229 (1.4); 2.9579 (1.3); 2.8850 (1.2); 2.5625 (16.0); 1.9798 (1.4); 1.9710 (1.5); 1.9590 (1.4); 1.9462 (1.9); 1.9388 (1.9); 1.7726 (0.8); 1.7629 (0.9); 1.7502 (1.6); 1.7401 (2.1); 1.7290 (1.4); 1.7179 (1.9); 1.7077 (1.2); 1.6958 (0.6); 1.6852 (0.6); 1.5625 (7.0); -0.0002 (6.7)
I.78: ¹ H-NMR(400.1 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2612 (10.3); 6.3202 (1.0); 5.1470 (0.5); 5.1315 (1.2); 5.1155 (1.5); 5.1001 (1.2); 5.0845 (0.5); 4.1574 (5.4); 4.1453 (5.3); 2.5608 (15.4); 1.5538 (12.7); 1.3017 (16.0); 1.2862 (15.8); -0.0002 (5.0)
I.79: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5272 (1.0); 8.5092 (1.0); 4.3603 (1.0); 4.3420 (1.6); 4.3238 (1.0); 2.8918 (0.4); 2.7333 (0.3); 2.7321 (0.3); 2.5124 (4.4); 2.5079 (8.9); 2.5033 (11.7); 2.4987 (8.3); 2.4941 (3.9); 2.4250 (16.0); 1.3709 (6.1); 1.3526 (6.0); -0.0002 (8.9)
I.80: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5409 (0.5); 8.5268 (1.0); 8.5123 (0.5); 7.9522 (0.5); 3.8951 (4.0); 3.8805 (4.0); 3.7792 (0.5); 3.6363 (1.2); 3.5437 (1.6); 3.3131 (0.5); 2.8944 (3.4); 2.7358 (2.8); 2.7347 (2.8); 2.5181 (3.6); 2.5137 (7.4); 2.5091 (9.8); 2.5045 (7.2); 2.5000 (3.5); 2.4085 (16.0); -0.0002 (4.1)

I.81: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5222 (0.9); 8.5043 (0.9); 7.9535 (1.9); 4.3621 (1.0); 4.3439 (1.5); 4.3257 (1.0); 2.8922 (13.5); 2.7335 (11.5); 2.7324 (11.0); 2.5458 (0.5); 2.5211 (0.3); 2.5126 (4.2); 2.5081 (8.4); 2.5035 (11.0); 2.4989 (7.8); 2.4944 (3.6); 2.3890 (16.0); 1.3757 (6.0); 1.3574 (5.9); -0.0002 (7.0)
I.82: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.3653 (1.0); 8.3452 (1.0); 7.9534 (0.4); 4.2186 (1.1); 4.2028 (1.2); 4.1985 (1.2); 4.1827 (1.1); 2.8922 (2.8); 2.7336 (2.3); 2.7323 (2.3); 2.5477 (0.5); 2.5211 (0.4); 2.5125 (4.6); 2.5080 (9.3); 2.5034 (12.2); 2.4988 (8.8); 2.4943 (4.2); 2.4457 (1.1); 2.3771 (16.0); 2.3708 (1.7); 2.1931 (0.5); 2.1763 (0.8); 2.1597 (0.8); 2.1429 (0.5); 0.9605 (10.5); 0.9434 (10.2); 0.9305 (0.5); 0.9183 (0.4); 0.9143 (0.5); 0.9025 (0.6); 0.8973 (0.4); 0.8862 (0.3); 0.0080 (0.3); -0.0002 (8.8)
I.83: ¹ H-NMR(400.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.2727 (2.2); 8.2525 (2.1); 7.9603 (1.5); 4.4433 (1.6); 4.4275 (2.1); 4.4112 (1.5); 3.3334 (18.0); 3.0685 (0.3); 2.8999 (6.7); 2.7406 (6.3); 2.5101 (8.9); 2.3781 (16.0); 1.9992 (1.2); 1.9830 (1.6); 1.9674 (1.3); 1.4459 (0.6); 1.4294 (1.0); 1.4122 (1.4); 1.3949 (1.3); 1.3786 (0.9); 1.2528 (0.9); 1.2359 (1.4); 1.2186 (1.4); 1.2015 (1.1); 1.1829 (0.6); 0.9330 (8.6); 0.9156 (12.1); 0.8961 (8.5); 0.8780 (4.0)
I.84: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5037 (1.1); 8.4838 (1.1); 7.9536 (0.7); 4.3579 (0.5); 4.3482 (0.4); 4.3427 (0.5); 4.3381 (0.6); 4.3315 (0.5); 4.3232 (0.4); 4.3116 (0.4); 2.8924 (4.8); 2.7338 (3.9); 2.7327 (4.1); 2.5475 (0.5); 2.5127 (4.9); 2.5083 (10.1); 2.5037 (13.4); 2.4991 (9.7); 2.4946 (4.7); 2.4386 (0.8); 2.3790 (16.0); 2.3711 (1.4); 1.7447 (0.4); 1.7289 (0.4); 1.7238 (0.4); 1.7174 (0.7); 1.7137 (0.7); 1.6983 (0.5); 1.6870 (0.8); 1.6709 (0.5); 1.6663 (0.5); 1.6545 (0.4); 1.6502 (0.4); 1.6027 (0.6); 1.5907 (0.4); 1.5809 (0.4); 1.5706 (0.8); 1.5600 (0.4); 0.9239 (5.3); 0.9080 (5.2); 0.8901 (5.0); 0.8743 (4.9); -0.0002 (8.0)
I.85: ¹ H-NMR(400.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5180 (1.9); 8.4991 (1.9); 7.9602 (0.8); 4.4520 (1.4); 4.4400 (1.4); 3.3307 (19.0); 2.8989 (3.5); 2.7400 (3.2); 2.5779 (1.5); 2.5580 (2.4); 2.5368 (2.6); 2.5103 (10.0); 2.3957 (13.6); 2.0614 (16.0); 2.0039 (0.8); 1.2642 (0.4); 1.2477 (0.4)
I.86: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5160 (1.3); 8.4958 (1.3); 7.9534 (1.4); 7.2874 (7.4); 7.2764 (12.3); 7.2659 (0.7); 7.2241 (0.8); 7.2130 (1.2); 7.2024 (1.3); 7.1948 (0.5); 7.1907 (0.7); 4.5618 (0.4); 4.5507 (0.5); 4.5414 (0.5); 4.5351 (0.7); 4.5310 (0.6); 4.5244 (0.5); 4.5152 (0.5); 4.5041 (0.4); 3.2195 (0.8); 3.2084 (0.9); 3.1850 (1.1); 3.1740 (1.0); 3.0347 (1.1); 3.0080 (1.1); 3.0003 (0.9); 2.9736 (0.8); 2.8909 (10.4); 2.7331 (8.7); 2.7320 (8.6); 2.5451 (0.6); 2.5209 (0.5); 2.5123 (6.5); 2.5078 (13.6); 2.5033 (18.0); 2.4987 (13.0); 2.4941 (6.3); 2.4423 (0.5); 2.1912 (16.0); 0.0080 (0.4); -0.0002 (11.9); -0.0085 (0.4)
I.87: ¹ H-NMR(400.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5093 (2.0); 8.4904 (2.0); 7.9600 (1.2); 4.4403 (1.5); 4.4292 (1.4); 3.5729 (0.4); 3.5582 (0.4); 3.3284 (60.1); 3.0720 (0.4); 2.8997 (5.2); 2.7405 (4.9); 2.5733 (1.7); 2.5542 (2.8); 2.5106 (17.5); 2.4335 (13.7); 2.0606 (16.0); 1.9943 (1.0); 1.2598 (0.5); 1.2435 (0.5)
I.88: ¹ H-NMR(400.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 8.5092 (2.3); 8.4901 (2.3); 7.9603 (2.4); 7.2839 (14.4); 7.2212 (2.1); 4.5415 (1.7); 3.3304 (51.8); 3.2177 (2.5); 3.1836 (2.6); 3.0679 (0.4); 3.0349 (1.8); 3.0061 (2.2); 2.9731 (1.3); 2.8984 (10.5); 2.7397 (10.0); 2.5105 (13.6); 2.2400 (16.0)
I.89: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 12.7827 (1.0); 8.2866 (2.9); 8.2699 (2.9); 4.4317 (2.5); 4.4215 (2.7); 4.4150 (2.6); 4.4047 (2.5); 3.3170 (3.0); 2.5116 (5.3); 2.5081 (11.0); 2.5046 (15.1); 2.5010 (11.0); 2.4975 (5.2); 2.4072 (38.2); 1.9991 (0.6); 1.9856 (1.4); 1.9731 (1.7); 1.9605 (1.4); 1.9470 (0.7); 1.4296 (0.9); 1.4162 (1.4); 1.4020 (2.0); 1.3877 (1.7); 1.3743 (1.2); 1.3597 (0.3); 1.2397 (1.2); 1.2249 (2.0); 1.2104 (1.7); 1.1975 (1.6); 1.1827 (1.0); 0.9221 (15.5); 0.9083 (15.9); 0.9035 (9.2); 0.8886 (16.0); 0.8738 (6.7)

I.90: ¹ H-NMR(300.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 12.7133 (0.7); 8.5333 (2.7); 8.5069 (2.8); 4.3890 (0.6); 4.3748 (1.2); 4.3624 (0.9); 4.3484 (1.5); 4.3400 (1.2); 4.3284 (0.7); 4.3136 (0.9); 3.3524 (16.0); 2.5339 (5.4); 2.5280 (11.2); 2.5219 (15.3); 2.5159 (11.2); 2.5101 (5.4); 2.4326 (33.0); 2.0956 (0.3); 1.7793 (0.5); 1.7648 (0.9); 1.7283 (2.0); 1.6984 (1.8); 1.6821 (1.5); 1.6639 (1.0); 1.6432 (0.8); 1.6170 (1.5); 1.5912 (0.8); 1.5778 (1.5); 1.5638 (0.9); 1.5513 (0.5); 0.9422 (10.2); 0.9217 (10.2); 0.9083 (10.3); 0.8876 (10.0); 0.0304 (0.4); 0.0194 (9.8); 0.0083 (0.4)
I.91: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2994 (2.8); 6.3458 (0.5); 6.3191 (0.5); 4.7660 (1.2); 4.7507 (1.2); 4.7379 (1.1); 4.7226 (1.1); 3.8211 (16.0); 2.5383 (15.5); 2.3377 (0.5); 2.3220 (0.5); 2.3148 (0.7); 2.2994 (0.7); 2.2919 (0.6); 2.2765 (0.5); 1.0442 (6.6); 1.0213 (6.6); 1.0101 (6.9); 0.9871 (6.5); 0.0350 (0.9)
I.92: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2990 (0.8); 6.4532 (1.3); 3.7374 (16.0); 2.5560 (15.5); 1.7066 (1.0); 1.7009 (1.2); 1.6839 (3.2); 1.6730 (3.4); 1.6578 (1.4); 1.3263 (1.4); 1.3108 (3.4); 1.3001 (3.3); 1.2833 (1.2); 0.0278 (1.0)
IVa.01: ¹ H-NMR(300.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 4.0799 (5.3); 4.0586 (5.4); 3.3415 (4.9); 2.5524 (17.9); 2.5343 (0.7); 2.5282 (1.2); 2.5221 (1.7); 2.5160 (1.2); 2.5100 (0.6); 2.0454 (0.4); 2.0232 (0.8); 2.0010 (1.0); 1.9789 (0.8); 1.9568 (0.4); 1.2627 (0.6); 0.9753 (16.0); 0.9529 (15.3); 0.8761 (0.6); 0.0180 (1.3)
IVa.02: ¹ H-NMR(499.9 MHz, CDCl ₃): δ= 7.2622 (1.9); 4.3528 (1.2); 4.3385 (4.0); 4.3242 (4.3); 4.3100 (1.9); 2.5262 (16.0); 2.4981 (1.1); 1.3792 (4.2); 1.3650 (8.5); 1.3507 (5.1); 1.3366 (1.2); 1.2972 (0.6); 1.2845 (0.7); 1.2536 (5.5); 1.1056 (0.3); 0.8885 (0.6); 0.8799 (0.9); 0.8739 (0.8); 0.8656 (0.9); 0.8558 (1.0); 0.8412 (0.9); -0.0002 (1.7)
IVa.03: ¹ H-NMR(400.1 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 4.0712 (5.4); 4.0552 (5.4); 3.3163 (4.8); 2.5139 (1.6); 2.5096 (2.2); 2.5053 (1.6); 2.4861 (17.1); 2.0251 (0.5); 2.0085 (0.9); 1.9919 (1.2); 1.9753 (1.0); 1.9587 (0.5); 0.9630 (16.0); 0.9462 (15.5)
VIa.01: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.7266 (0.9); 7.2983 (1.8); 4.3473 (2.2); 4.3235 (6.6); 4.2997 (6.8); 4.2799 (9.4); 4.2639 (8.9); 1.6684 (1.5); 1.3796 (8.0); 1.3558 (16.0); 1.3319 (7.7); 0.0290 (2.0)
VIa.02: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.6832 (0.5); 7.2980 (1.8); 4.3203 (5.0); 4.3043 (4.9); 3.8640 (16.0); 1.6217 (0.6); 0.0330 (2.2)
VIa.03: ¹ H-NMR(300.2 MHz, CDCl ₃): δ= 7.6908 (0.5); 7.2986 (3.4); 4.3181 (4.8); 4.3021 (4.8); 3.8644 (16.0); 2.0812 (0.4); 1.6018 (1.6); 0.0358 (4.1)
VIa.04: ¹ H-NMR(400.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.0297 (2.9); 4.1005 (2.1); 4.0828 (6.7); 4.0651 (6.7); 4.0473 (2.1); 3.3285 (11.9); 2.5220 (0.4); 2.5133 (6.0); 2.5088 (12.5); 2.5042 (16.6); 2.4995 (12.0); 2.4950 (5.9); 1.4637 (1.8); 1.4515 (4.4); 1.4431 (4.8); 1.4322 (2.0); 1.1946 (2.2); 1.1820 (10.0); 1.1753 (4.9); 1.1641 (16.0); 1.1463 (7.1); -0.0002 (0.4)
VIa.05: ¹ H-NMR(499.9 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 9.1058 (3.8); 4.1569 (2.1); 4.1426 (6.5); 4.1284 (6.6); 4.1143 (2.1); 3.3757 (1.0); 2.5650 (0.4); 2.5615 (0.8); 2.5579 (1.0); 2.5543 (0.8); 2.5508 (0.4); 1.5126 (1.8); 1.5030 (4.7); 1.4964 (5.0); 1.4875 (2.0); 1.2481 (7.1); 1.2338 (16.0); 1.2238 (5.6); 1.2196 (9.1); 1.2076 (1.9)
VIa.06: ¹ H-NMR(300.2 MHz, d ₆ -DMSO): δ= 12.5912 (0.3); 12.5704 (0.3); 8.9622 (5.6); 3.3582 (16.0); 2.5348 (7.3); 2.5289 (15.6); 2.5228 (21.8); 2.5167 (15.8); 2.5108 (7.3); 1.4582 (2.0); 1.4422 (5.0); 1.4314 (5.7); 1.4172 (2.5); 1.1587 (2.6); 1.1445 (5.5); 1.1336 (5.4); 1.1178 (2.0); 0.0317 (1.0); 0.0207 (30.4); 0.0098 (1.1)

VIa.07: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 9.0605 (4.1); 8.3150 (0.5); 4.1032 (2.2); 4.0855 (7.1); 4.0677 (7.1); 4.0500 (2.3); 3.3287 (15.8); 2.8923 (0.7); 2.7326 (0.6); 2.5263 (0.4); 2.5216 (0.6); 2.5128 (8.7); 2.5084 (18.0); 2.5038 (23.9); 2.4992 (17.7); 2.4948 (8.9); 1.4546 (1.8); 1.4425 (4.6); 1.4343 (5.1); 1.4233 (2.1); 1.1961 (7.7); 1.1783 (16.0); 1.1693 (2.6); 1.1604 (9.6); 1.1499 (5.1); 1.1378 (1.8); -0.0002 (0.5)
VIa.08: 1H-NMR(300.2 MHz, d6-DMSO): δ= 9.0801 (2.6); 3.6446 (16.0); 3.3477 (11.1); 2.5279 (2.3); 2.5220 (3.1); 2.5161 (2.2); 1.4960 (1.0); 1.4795 (2.8); 1.4685 (3.1); 1.4541 (1.3); 1.2106 (1.4); 1.1961 (3.1); 1.1851 (2.9); 1.1685 (1.1); 0.0189 (2.7)
VIa.09: 1H-NMR(300.2 MHz, d6-DMSO): δ= 12.6292 (0.5); 12.5891 (0.6); 12.5706 (0.6); 12.5368 (0.5); 8.9512 (15.1); 6.8906 (0.3); 3.3471 (16.0); 2.5343 (14.3); 2.5283 (29.9); 2.5222 (40.7); 2.5161 (28.9); 2.5102 (13.1); 2.2042 (0.5); 2.0093 (1.1); 1.9289 (0.4); 1.4951 (0.3); 1.4457 (5.1); 1.4297 (12.6); 1.4189 (14.1); 1.4050 (6.2); 1.3753 (4.2); 1.3509 (0.6); 1.2561 (0.6); 1.2184 (0.5); 1.2012 (1.5); 1.1949 (1.1); 1.1708 (0.7); 1.1518 (6.7); 1.1379 (14.3); 1.1271 (13.5); 1.1112 (5.0); 0.0308 (1.6); 0.0200 (45.4); 0.0090 (1.5)
VIa.10: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7446 (0.8); 8.7304 (1.7); 8.7161 (0.8); 4.1608 (2.2); 4.1430 (7.0); 4.1252 (7.1); 4.1075 (2.3); 4.0177 (6.3); 4.0032 (6.3); 3.3296 (12.4); 2.8929 (0.6); 2.7342 (0.5); 2.7332 (0.5); 2.5270 (0.4); 2.5223 (0.6); 2.5135 (7.2); 2.5091 (14.7); 2.5045 (19.2); 2.4999 (13.9); 2.4954 (6.7); 1.2357 (8.0); 1.2179 (16.0); 1.2001 (7.6); -0.0002 (0.4)
VIa.11: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.5453 (1.5); 8.5258 (1.5); 4.3175 (1.6); 4.3022 (1.8); 4.2980 (1.8); 4.2826 (1.6); 4.2026 (1.0); 4.1934 (0.8); 4.1849 (1.0); 4.1757 (2.7); 4.1664 (1.2); 4.1579 (2.9); 4.1485 (2.9); 4.1399 (1.2); 4.1308 (2.8); 4.1215 (1.1); 4.1131 (0.9); 4.1037 (1.1); 4.0860 (0.3); 3.3279 (12.9); 2.8931 (0.9); 2.7344 (0.7); 2.7330 (0.7); 2.5268 (0.4); 2.5221 (0.6); 2.5134 (8.1); 2.5089 (16.5); 2.5043 (21.5); 2.4996 (15.3); 2.4951 (7.2); 2.2143 (0.8); 2.1976 (1.2); 2.1813 (1.3); 2.1645 (0.8); 1.2379 (7.9); 1.2201 (16.0); 1.2023 (7.4); 0.9932 (9.5); 0.9770 (14.5); 0.9607 (8.7); -0.0002 (0.5)
VIa.12: 1H-NMR(499.9 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7100 (1.0); 8.6988 (1.8); 8.6874 (0.9); 4.1628 (2.4); 4.1486 (7.0); 4.1343 (7.0); 4.1201 (2.2); 4.0351 (6.9); 4.0236 (6.7); 3.3227 (1.6); 2.5139 (0.4); 2.5104 (0.7); 2.5067 (0.9); 2.5031 (0.6); 1.2367 (8.0); 1.2224 (16.0); 1.2082 (7.6)
VIa.13: 1H-NMR(300.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.5980 (0.5); 3.9800 (1.7); 3.9611 (1.7); 3.3447 (16.0); 2.5345 (3.3); 2.5285 (7.1); 2.5224 (9.9); 2.5164 (7.2); 2.5104 (3.3); 2.0099 (0.4); 0.0317 (0.4); 0.0208 (14.2); 0.0098 (0.5)
VIa.14: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7570 (1.9); 8.7380 (2.0); 7.3230 (0.9); 7.3202 (1.4); 7.3165 (0.6); 7.3022 (4.0); 7.2996 (3.1); 7.2899 (1.2); 7.2846 (5.3); 7.2719 (4.3); 7.2678 (6.6); 7.2614 (1.1); 7.2511 (2.6); 7.2465 (2.4); 7.2426 (1.6); 7.2375 (0.8); 7.2308 (0.9); 7.2248 (2.4); 7.2178 (0.5); 7.2120 (0.5); 7.2075 (0.8); 7.2034 (0.4); 4.6413 (0.6); 4.6273 (0.8); 4.6188 (1.1); 4.6081 (1.0); 4.6050 (1.0); 4.5998 (0.9); 4.5857 (0.7); 4.1411 (1.5); 4.1235 (4.8); 4.1064 (5.2); 4.0887 (1.8); 3.3294 (20.9); 3.1759 (0.9); 3.1620 (1.0); 3.1414 (1.8); 3.1277 (1.6); 3.0775 (1.7); 3.0546 (1.7); 3.0431 (1.0); 3.0202 (0.9); 2.8913 (1.0); 2.7333 (0.8); 2.7322 (0.8); 2.5258 (0.6); 2.5210 (0.8); 2.5124 (11.3); 2.5080 (22.9); 2.5034 (29.8); 2.4988 (21.4); 2.4942 (10.2); 1.1871 (7.6); 1.1693 (16.0); 1.1515 (7.3); -0.0002 (0.6)

VIa.15: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7592 (1.8); 8.7404 (1.9); 4.4041 (0.7); 4.3918 (0.7); 4.3852 (0.9); 4.3786 (1.1); 4.3731 (0.9); 4.3669 (0.8); 4.3599 (0.9); 4.3479 (0.6); 4.1667 (0.6); 4.1575 (1.0); 4.1488 (0.8); 4.1459 (1.2); 4.1397 (3.2); 4.1282 (3.4); 4.1219 (3.4); 4.1104 (3.3); 4.1041 (1.3); 4.1015 (1.0); 4.0927 (1.0); 4.0835 (0.7); 3.3280 (13.4); 2.8930 (1.0); 2.7334 (0.9); 2.5267 (0.4); 2.5219 (0.6); 2.5132 (9.0); 2.5088 (18.2); 2.5043 (23.9); 2.4997 (17.3); 2.4952 (8.4); 1.7758 (0.5); 1.7706 (0.5); 1.7624 (0.8); 1.7563 (1.1); 1.7469 (1.5); 1.7284 (1.2); 1.7211 (1.6); 1.7085 (0.8); 1.6956 (1.1); 1.6830 (0.8); 1.6100 (0.6); 1.6055 (0.5); 1.5938 (1.0); 1.5838 (0.9); 1.5721 (1.6); 1.5606 (0.8); 1.5480 (0.4); 1.5380 (0.5); 1.2249 (7.8); 1.2072 (16.0); 1.1894 (7.5); 0.9325 (9.4); 0.9165 (9.4); 0.9040 (9.2); 0.8879 (8.8); -0.0002 (0.5)
VIa.16: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.8160 (1.0); 8.7974 (1.0); 4.5250 (0.4); 4.5112 (0.5); 4.5045 (0.7); 4.4913 (0.6); 4.4853 (0.5); 4.4715 (0.4); 4.1686 (0.5); 4.1583 (0.7); 4.1508 (1.6); 4.1404 (1.7); 4.1329 (1.7); 4.1227 (1.6); 4.1146 (0.7); 4.1049 (0.5); 3.3280 (6.7); 2.6263 (0.7); 2.6105 (1.3); 2.5910 (1.7); 2.5721 (0.7); 2.5662 (0.4); 2.5566 (0.6); 2.5128 (4.9); 2.5084 (9.7); 2.5039 (12.6); 2.4993 (9.2); 2.4949 (4.5); 2.0655 (16.0); 2.0549 (1.0); 2.0455 (0.9); 2.0413 (0.8); 2.0300 (0.7); 2.0253 (0.6); 2.0095 (0.4); 1.2317 (3.8); 1.2242 (0.6); 1.2139 (7.7); 1.1961 (3.6)
VIa.17: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.4679 (1.4); 8.4484 (1.4); 4.3306 (1.8); 4.3155 (2.0); 4.3111 (2.0); 4.2960 (1.8); 4.2263 (0.3); 4.2085 (1.1); 4.1993 (0.9); 4.1908 (1.1); 4.1815 (2.9); 4.1701 (1.1); 4.1637 (3.0); 4.1523 (3.0); 4.1460 (1.1); 4.1346 (3.0); 4.1253 (1.2); 4.1169 (0.9); 4.1076 (1.1); 4.0898 (0.4); 3.3272 (13.7); 2.5269 (0.4); 2.5222 (0.6); 2.5135 (7.8); 2.5091 (15.6); 2.5045 (20.3); 2.4999 (14.6); 2.4954 (7.0); 2.2189 (0.9); 2.2021 (1.4); 2.1861 (1.4); 2.1693 (0.9); 1.2350 (8.1); 1.2172 (16.0); 1.1995 (7.6); 0.9813 (10.9); 0.9679 (12.2); 0.9644 (12.1); 0.9509 (10.0); -0.0002 (0.4)
VIa.18: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7118 (1.5); 8.6928 (1.5); 4.4275 (0.5); 4.4158 (0.9); 4.4087 (0.7); 4.4029 (0.8); 4.3968 (1.0); 4.3907 (0.9); 4.3840 (0.6); 4.3717 (0.7); 4.1696 (0.6); 4.1605 (1.0); 4.1500 (1.2); 4.1427 (3.1); 4.1322 (3.3); 4.1248 (3.3); 4.1144 (3.2); 4.1069 (1.2); 4.0968 (1.0); 4.0874 (0.6); 3.3279 (16.2); 2.8936 (1.4); 2.7345 (1.2); 2.7333 (1.1); 2.5269 (0.4); 2.5221 (0.6); 2.5134 (7.8); 2.5090 (15.8); 2.5044 (20.5); 2.4997 (14.6); 2.4952 (6.9); 1.7756 (0.5); 1.7632 (0.8); 1.7497 (0.5); 1.7377 (1.5); 1.7310 (1.5); 1.7139 (1.9); 1.7012 (1.0); 1.6850 (0.4); 1.6146 (0.7); 1.6003 (0.8); 1.5888 (1.5); 1.5772 (0.8); 1.2332 (0.3); 1.2201 (7.7); 1.2024 (16.0); 1.1846 (7.4); 0.9318 (8.4); 0.9160 (8.0); 0.9001 (8.0); 0.8841 (7.6); -0.0002 (0.4)
VIa.19: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7776 (0.7); 8.7591 (0.8); 4.5404 (0.4); 4.5346 (0.6); 4.5210 (0.5); 4.5154 (0.4); 4.5011 (0.3); 4.1724 (0.4); 4.1634 (0.7); 4.1545 (1.5); 4.1454 (1.7); 4.1367 (1.6); 4.1277 (1.5); 4.1187 (0.8); 4.1100 (0.5); 3.3275 (6.3); 2.8934 (0.8); 2.7345 (0.7); 2.7331 (0.7); 2.6019 (0.6); 2.5865 (1.1); 2.5834 (0.9); 2.5671 (1.6); 2.5518 (0.4); 2.5487 (0.6); 2.5134 (3.5); 2.5088 (7.0); 2.5042 (9.2); 2.4996 (6.6); 2.4950 (3.2); 2.0904 (0.4); 2.0854 (0.4); 2.0764 (0.5); 2.0714 (0.9); 2.0602 (16.0); 2.0491 (0.8); 2.0451 (0.6); 2.0389 (0.4); 2.0286 (0.4); 1.2275 (3.7); 1.2189 (0.3); 1.2098 (7.6); 1.1920 (3.5)
VIa.20: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.6332 (1.6); 8.6144 (1.6); 7.3226 (0.8); 7.3198 (1.3); 7.3160 (0.6); 7.3018 (3.7); 7.2993 (3.2); 7.2900 (1.2); 7.2843 (5.4); 7.2746 (4.6); 7.2706 (6.8); 7.2641 (1.0); 7.2541 (2.4); 7.2498 (1.4); 7.2465 (1.6); 7.2428 (1.5); 7.2374 (0.8); 7.2312 (0.9); 7.2251 (2.3); 7.2180 (0.5); 7.2128 (0.5); 7.2080 (0.8); 7.2038 (0.4); 4.6760 (0.7); 4.6622 (0.9); 4.6569 (1.0); 4.6537 (1.2); 4.6432 (1.0); 4.6401 (1.0); 4.6348 (1.0); 4.6209 (0.7); 4.1481 (1.5); 4.1317 (4.6); 4.1304 (4.6); 4.1138 (5.0); 4.0959 (1.7); 3.3305 (17.0); 3.2003 (0.9); 3.1866 (1.0); 3.1658 (1.8); 3.1522 (1.7); 3.1031 (1.8); 3.0805 (1.8); 3.0687 (1.0); 3.0461 (1.0); 2.8916 (1.0); 2.7338 (0.8); 2.7327 (0.9); 2.5264 (0.4); 2.5216 (0.6); 2.5129 (8.5); 2.5085 (17.0); 2.5039 (22.1); 2.4993 (15.9); 2.4947 (7.6); 1.1861 (7.7); 1.1684 (16.0); 1.1506 (7.4); -0.0002 (0.4)

VIa.21: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.5103 (1.4); 8.4908 (1.4); 4.3318 (1.4); 4.3166 (1.7); 4.3124 (1.6); 4.2971 (1.4); 4.2063 (0.8); 4.1970 (0.7); 4.1885 (0.8); 4.1793 (2.2); 4.1704 (1.0); 4.1615 (2.3); 4.1526 (2.3); 4.1436 (1.0); 4.1348 (2.3); 4.1256 (0.8); 4.1171 (0.7); 4.1078 (0.8); 3.3229 (19.1); 2.5250 (0.5); 2.5117 (10.5); 2.5073 (21.4); 2.5028 (28.2); 2.4983 (20.2); 2.4938 (9.7); 2.2231 (0.7); 2.2063 (1.2); 2.1900 (1.2); 2.1733 (0.8); 1.2391 (6.6); 1.2214 (13.0); 1.2036 (6.0); 0.9988 (8.7); 0.9816 (16.0); 0.9643 (8.0); -0.0002 (5.3)
VIa.22: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7477 (2.1); 8.7289 (2.1); 4.4118 (0.8); 4.3994 (0.8); 4.3928 (1.0); 4.3867 (1.2); 4.3809 (0.9); 4.3749 (0.8); 4.3680 (1.0); 4.3560 (0.6); 4.1690 (0.6); 4.1597 (1.0); 4.1486 (1.3); 4.1420 (3.2); 4.1308 (3.4); 4.1242 (3.4); 4.1131 (3.2); 4.1062 (1.3); 4.0954 (1.0); 4.0861 (0.6); 3.3229 (26.7); 2.5250 (0.7); 2.5113 (14.8); 2.5070 (30.5); 2.5026 (40.5); 2.4981 (29.6); 2.4937 (14.6); 1.7949 (0.3); 1.7786 (0.6); 1.7621 (1.3); 1.7531 (1.4); 1.7303 (2.0); 1.7178 (0.9); 1.7047 (1.3); 1.6920 (0.8); 1.6176 (0.6); 1.6015 (1.0); 1.5916 (0.9); 1.5799 (1.7); 1.5684 (0.8); 1.5549 (0.4); 1.5458 (0.5); 1.2389 (0.7); 1.2251 (7.8); 1.2074 (16.0); 1.1896 (7.6); 0.9345 (9.8); 0.9186 (9.9); 0.9051 (9.7); 0.8891 (9.4); -0.0002 (7.2)
VIa.23: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.8083 (1.0); 8.7898 (1.0); 4.5337 (0.3); 4.5137 (0.6); 4.4998 (0.6); 4.4947 (0.5); 4.4804 (0.3); 4.1713 (0.5); 4.1613 (0.6); 4.1535 (1.5); 4.1433 (1.6); 4.1356 (1.6); 4.1256 (1.5); 4.1174 (0.7); 4.1079 (0.5); 3.3232 (10.4); 2.6291 (0.7); 2.6137 (1.3); 2.5945 (1.7); 2.5761 (0.7); 2.5613 (0.3); 2.5115 (6.4); 2.5071 (13.2); 2.5026 (17.5); 2.4981 (12.8); 2.4937 (6.3); 2.0813 (0.5); 2.0662 (16.0); 2.0485 (0.8); 2.0389 (0.8); 2.0304 (0.4); 2.0185 (0.4); 1.2323 (3.7); 1.2146 (7.5); 1.1968 (3.5); -0.0002 (3.4)
VIa.24: 1H-NMR(400.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.7327 (2.0); 8.7139 (2.0); 7.3206 (1.4); 7.3025 (4.2); 7.2902 (1.4); 7.2847 (5.6); 7.2683 (7.1); 7.2515 (2.8); 7.2471 (2.6); 7.2432 (1.8); 7.2312 (1.0); 7.2254 (2.4); 7.2187 (0.5); 7.2126 (0.5); 7.2082 (0.8); 4.6559 (0.7); 4.6418 (1.0); 4.6337 (1.2); 4.6227 (1.1); 4.6199 (1.1); 4.6146 (1.0); 4.6006 (0.7); 4.1446 (1.6); 4.1374 (0.3); 4.1271 (5.3); 4.1096 (5.6); 4.0996 (0.3); 4.0919 (1.9); 3.3249 (32.0); 3.1832 (1.0); 3.1692 (1.1); 3.1487 (2.0); 3.1349 (1.8); 3.0878 (1.9); 3.0651 (1.9); 3.0534 (1.1); 3.0307 (1.0); 2.8912 (0.4); 2.7321 (0.3); 2.5246 (0.8); 2.5113 (17.7); 2.5070 (35.1); 2.5025 (45.5); 2.4979 (32.5); 2.4935 (15.5); 1.2389 (0.6); 1.1887 (7.7); 1.1709 (16.0); 1.1532 (7.4); -0.0002 (7.0)
VIIIa.01: 1H-NMR(499.9 MHz, CDCl3): δ= 7.2672 (1.2); 4.4055 (2.5); 4.3912 (7.7); 4.3769 (7.8); 4.3627 (2.6); 2.0088 (0.9); 1.4065 (8.0); 1.3922 (16.0); 1.3780 (8.0); 1.2628 (0.4); 1.2538 (1.0); -0.0002 (1.4)
VIIIa.02: 1H-NMR(300.2 MHz, CDCl3): δ= 7.6041 (0.4); 7.2984 (2.1); 3.9506 (16.0); 3.9244 (1.2); 1.5852 (1.8); 0.0364 (2.4)

VIIIa.03: 1H-NMR(499.9 MHz, d6-DMSO): δ= 15.1027 (0.3); 14.9975 (0.4); 14.9759 (0.4); 14.9509 (0.4); 14.9312 (0.4); 14.8896 (0.4); 14.8671 (0.5); 14.8450 (0.5); 14.7865 (0.6); 14.7539 (0.7); 14.6142 (1.0); 14.5943 (1.2); 14.5485 (1.4); 14.5271 (1.5); 14.5236 (1.5); 14.2968 (4.7); 14.1541 (7.0); 14.0699 (5.8); 13.9449 (3.2); 13.8394 (2.0); 13.5699 (0.8); 13.5440 (0.8); 13.4921 (0.6); 13.4731 (0.6); 13.4502 (0.6); 13.4216 (0.6); 13.3628 (0.5); 13.3451 (0.5); 13.3306 (0.4); 13.2703 (0.5); 13.2252 (0.4); 13.2010 (0.4); 13.1591 (0.4); 13.1269 (0.3); 13.0464 (0.3); 7.7544 (8.9); 7.4284 (1.4); 4.5359 (0.3); 4.4060 (0.3); 4.3940 (0.3); 4.3632 (0.4); 4.3500 (0.4); 4.3401 (0.4); 4.2742 (0.4); 4.2369 (0.4); 4.2278 (0.5); 4.2094 (0.5); 4.1782 (0.5); 4.1293 (0.5); 4.1189 (0.6); 4.1132 (0.6); 4.1025 (0.6); 4.0515 (0.6); 4.0446 (0.7); 4.0191 (0.7); 3.9836 (0.8); 3.9763 (0.8); 3.9301 (0.9); 3.8612 (1.0); 3.4109 (6.4); 3.3496 (7.0); 3.1621 (3.7); 2.8672 (1.0); 2.8488 (1.0); 2.8394 (0.9); 2.8120 (0.8); 2.8052 (0.8); 2.7588 (0.9); 2.7233 (0.7); 2.7027 (0.7); 2.6458 (1.7); 2.6421 (2.1); 2.6172 (0.7); 2.5952 (0.7); 2.5818 (0.7); 2.5143 (96.0); 2.5108 (196.0); 2.5072 (264.8); 2.5037 (189.8); 2.5002 (88.3); 2.3720 (1.1); 2.3683 (1.6); 2.3644 (1.2); 2.1856 (0.5); 2.0896 (16.0); 2.0780 (0.4); 1.9135 (0.5); 1.3579 (3.0); 1.3421 (1.0); 1.3177 (0.4); 1.3006 (1.0); 1.2736 (0.5); 1.2600 (1.1); 1.2307 (1.5); 1.2053 (0.4); 1.1833 (2.4); 1.1716 (1.1); 1.0969 (0.4); 0.8541 (0.5)
VIIIa.04: 1H-NMR(499.9 MHz, d6-DMSO): δ= 3.8598 (16.0); 3.3560 (0.5); 2.5322 (0.6); 2.5288 (1.2); 2.5253 (1.7); 2.5217 (1.2); 2.5184 (0.6)
VIIIa.05: 1H-NMR(300.2 MHz, CDCl3): δ= 7.2983 (1.3); 3.9521 (16.0); 1.5875 (0.4); 0.0350 (1.7)
VIIIa.06: 1H-NMR(300.2 MHz, d6-DMSO): δ= 19.6514 (1.2); 19.4242 (1.2); 14.4211 (1.5); 14.2144 (4.5); 14.0488 (9.5); 13.9419 (4.6); 13.7837 (1.7); 13.6736 (1.2); 13.6487 (1.2); 13.5662 (1.3); 9.3511 (1.3); 5.7749 (3.0); 4.0838 (1.6); 4.0599 (3.6); 4.0367 (3.6); 4.0129 (1.4); 3.7199 (1.5); 3.6986 (1.4); 3.6881 (1.6); 3.6447 (2.0); 3.5905 (2.2); 3.5604 (2.8); 3.3605 (11.6); 3.1076 (1.9); 3.0934 (1.9); 3.0852 (2.0); 3.0078 (1.6); 2.9717 (1.3); 2.9121 (1.4); 2.8858 (1.6); 2.7479 (1.7); 2.5339 (95.7); 2.5278 (198.8); 2.5217 (271.4); 2.5157 (195.8); 2.5096 (91.8); 2.4429 (1.8); 2.4204 (1.3); 2.2912 (2.1); 2.0080 (16.0); 1.2510 (7.5); 1.2177 (5.6); 1.1940 (10.0); 1.1702 (5.6); 0.8674 (1.7); 0.8481 (1.5); 0.8110 (1.2); 0.0286 (13.0); 0.0178 (337.9); 0.0069 (13.0); -0.0500 (1.4); -0.1807 (1.7)
VIIIa.07: 1H-NMR(499.9 MHz, CDCl3): δ= 7.2630 (2.8); 4.4029 (2.5); 4.3887 (7.6); 4.3744 (7.7); 4.3601 (2.6); 2.0073 (0.6); 1.5552 (2.0); 1.4026 (8.0); 1.3883 (16.0); 1.3740 (7.8); 1.2543 (0.5); -0.0002 (3.2)
VIIIa.08: 1H-NMR(499.9 MHz, CDCl3): δ= 7.2606 (15.4); 5.2995 (3.1); 4.3996 (2.5); 4.3853 (7.7); 4.3710 (7.8); 4.3568 (2.6); 1.5458 (28.2); 1.3998 (8.0); 1.3856 (16.0); 1.3713 (7.9); 1.2560 (0.6); -0.0002 (15.9)
IXb.01: 1H-NMR(300.2 MHz, CDCl3): δ= 7.3562 (4.5); 7.2987 (4.8); 6.3762 (1.1); 4.2401 (1.4); 4.2163 (4.4); 4.1925 (4.5); 4.1688 (1.5); 2.5394 (16.0); 1.7118 (1.3); 1.6952 (3.6); 1.6843 (3.8); 1.6692 (1.7); 1.6163 (0.3); 1.3412 (1.7); 1.3261 (3.7); 1.3153 (3.7); 1.2979 (6.0); 1.2740 (9.6); 1.2502 (4.6); 0.0354 (6.2)
IXa.01: 1H-NMR(600.1 MHz, d6-DMSO): δ= 8.6444 (2.5); 8.3131 (4.9); 7.1174 (6.0); 4.0758 (1.6); 4.0640 (5.0); 4.0522 (5.0); 4.0404 (1.6); 3.3303 (5.5); 3.3257 (16.0); 3.3238 (13.3); 3.3012 (1.6); 2.5080 (5.1); 2.5052 (10.5); 2.5022 (14.0); 2.4993 (9.8); 2.4967 (4.5); 2.3608 (18.4); 2.1549 (0.4); 1.4162 (1.5); 1.4084 (3.9); 1.4029 (4.2); 1.3955 (1.6); 1.2397 (0.5); 1.1588 (5.3); 1.1469 (11.0); 1.1405 (1.8); 1.1350 (7.0); 1.1276 (3.7); 1.1196 (1.3)
IXa.02: 1H-NMR(600.1 MHz, d6-DMSO): δ= 8.3748 (0.6); 8.3652 (1.2); 8.3555 (0.6); 7.1387 (5.8); 4.1343 (1.6); 4.1225 (5.0); 4.1106 (5.0); 4.0988 (1.6); 3.9322 (5.2); 3.9224 (5.2); 3.3259 (16.0); 2.8913 (0.4); 2.5081 (4.3); 2.5052 (9.3); 2.5021 (12.9); 2.4991 (9.2); 2.4961 (4.2); 2.3919 (18.2); 2.1680 (0.4); 1.2393 (0.5); 1.2146 (5.6); 1.2100 (0.3); 1.2027 (11.6); 1.1981 (0.6); 1.1909 (5.5)

IXa.03: 1H-NMR(600.1 MHz, d6-DMSO): δ= 8.2288 (0.6); 8.2159 (0.6); 7.1279 (2.7); 7.1274 (2.6); 4.1797 (0.7); 4.1717 (0.6); 4.1677 (1.1); 4.1599 (0.6); 4.1547 (1.0); 4.1538 (1.1); 4.1418 (0.9); 4.1131 (0.9); 4.1013 (0.9); 4.0951 (0.5); 4.0832 (0.5); 3.3309 (5.8); 3.3227 (16.0); 2.8917 (0.5); 2.7326 (0.4); 2.7318 (0.4); 2.5081 (2.6); 2.5051 (5.9); 2.5020 (8.3); 2.4990 (6.1); 2.4960 (3.0); 2.3704 (8.8); 2.1646 (0.4); 2.1532 (0.6); 2.1418 (0.6); 2.1304 (0.4); 1.2129 (2.9); 1.2010 (6.0); 1.1957 (0.4); 1.1892 (2.8); 0.9602 (3.8); 0.9489 (3.8); 0.9372 (3.7); 0.9259 (3.7)
IXa.04: 1H-NMR(600.1 MHz, d6-DMSO): δ= 8.3807 (0.4); 8.3678 (0.4); 7.2942 (1.0); 7.2836 (2.3); 7.2809 (1.8); 7.2706 (0.3); 7.2189 (0.4); 7.0902 (1.6); 4.1169 (0.7); 4.1141 (0.7); 4.1050 (0.7); 4.1023 (0.7); 3.3462 (5.2); 3.3412 (15.2); 3.3404 (16.0); 3.1372 (0.4); 3.1285 (0.3); 3.0677 (0.4); 3.0507 (0.4); 2.5147 (1.5); 2.5118 (3.3); 2.5088 (4.6); 2.5058 (3.4); 2.5029 (1.6); 2.2220 (4.5); 1.1714 (1.4); 1.1596 (3.0); 1.1478 (1.4)
Xa.01: 1H-NMR(300.2 MHz, d6-DMSO): δ= 8.1387(1.3); 6.3153(1.9); 4.0968(0.6); 4.0731(2.1); 4.0495(2.1); 4.0259(0.7); 3.3400(16.0); 2.5351(0.6); 2.5291(1.4); 2.5230(1.9); 2.5169(1.4); 2.5108(0.6); 2.3046(7.5); 1.4114(0.5); 1.3953(1.2); 1.3843(1.4); 1.3703(0.6); 1.1820(2.2); 1.1583(4.8); 1.1347(2.2); 1.1258(0.7); 1.1115(1.4); 1.1005(1.3); 1.0842(0.5); 0.0217(1.9)
XIa.01: 1H-NMR(300.2 MHz, CDCl3): δ= 7.2987 (3.5); 6.2815 (0.7); 4.2225 (0.6); 4.1988 (2.1); 4.1750 (2.1); 4.1513 (0.7); 3.8296 (0.9); 3.4388 (1.6); 2.8084 (2.5); 2.5446 (1.6); 2.5326 (7.3); 1.6725 (0.7); 1.6561 (1.6); 1.6453 (1.6); 1.6302 (0.8); 1.5840 (16.0); 1.2824 (2.2); 1.2587 (4.7); 1.2501 (1.4); 1.2350 (2.6); 1.2229 (0.5); 0.0341 (3.4)
XIIIa.01: 1H-NMR(499.9 MHz, d6-DMSO): δ= 4.2571 (0.5); 4.2430 (1.6); 4.2288 (1.6); 4.2146 (0.5); 3.3173 (2.7); 2.5080 (0.7); 2.5046 (1.0); 2.5012 (0.8); 2.4380 (5.9); 1.4974 (16.0); 1.2924 (1.6); 1.2782 (3.4); 1.2640 (1.7)
XIIIa.02: 1H-NMR(499.9 MHz, d6-DMSO): δ= 3.3167 (18.1); 2.5081 (8.0); 2.5046 (11.3); 2.5011 (8.8); 2.4215 (5.9); 1.4920 (16.0); 1.2394 (1.8)

【0196】

生物資料

【0197】

實例A：野油菜黃單胞菌野油菜致病變種活體外細胞測試

溶劑：DMSO

培養基：LB肉汁培養基(Luria Broth Miller) Sigma

接種體：細菌懸浮液

【0198】 將待測試化合物溶解於DMSO及用於製備所需濃度範圍之溶液中。用於分析之DMSO之最終濃度為≤1%。

【0199】 接種體由在液體培養基中生長之細菌之預培養物製備，且

稀釋至所需光密度(OD)。

【0200】 評估化合物抑制液體培養基分析中細菌生長之能力。以所需濃度將化合物添加至含有細菌懸浮液之培養基中。在培養24 h之後，藉由細菌生長之光譜量測來測定化合物之功效。藉由將含有化合物之孔之吸收值與無化合物之對照孔之吸收進比較來測定抑制。

【0201】 在此測試中，根據本發明之以下化合物在所測試化合物之20 ppm濃度下未展示直接活性：I.01；I.02；I.03；I.04；I.05；I.06；I.07；I.08；I.09；I.10；I.11；I.12；I.13；I.14；I.15；I.17；I.18；I.19；I.20；I.21；I.22；I.23；I.24；I.25；I.26；I.27；I.28；I.29；I.30；I.31；I.32；I.33；I.34；I.35；I.36；I.37；I.38；I.39；I.40；I.41；I.42；I.43；I.44；I.45；I.46；I.47；I.48；I.49；I.50；I.51；I.52；I.53；I.54；I.55；I.56；I.57；I.58；I.59；I.60；I.61。

【0202】

實例B：對野油菜黃單胞菌野油菜致病變種(對甘藍菜之黑腐病)之活體內預防性測試

所測試化合物藉由在丙酮/二甲亞砒/tween®之混合物中均質化來製備，且接著用水稀釋以獲得所需濃度。

【0203】 藉由噴灑如上文所描述製備之所測試化合物來處理甘藍菜之幼株。僅用丙酮/二甲亞砒/tween®之水溶液處理對照植物。

【0204】 在72小時之後，藉由用野油菜黃單胞菌野油菜致病變種之水性細菌懸浮液噴灑葉片來污染植物。在27°C下在95%相對濕度下將經污染之甘藍菜植物培育8或10天。

【0205】 在接種後8或10天對測試進行評估。0%意謂對應於對照植

物之功效的功效，而100%之功效意謂未觀測到病害。

【0206】 在此測試中，根據本發明之以下化合物在所測試化合物之 31 ppm濃度下展示70%與79%之間的功效：I.08；I.11；I.32；I.34；I.44；I.45；I.50；I.59；I.60；I.68；I.74；I.79；I.80；I.81；I.82；I.90；I.58。

【0207】 在此測試中，根據本發明之以下化合物在所測試化合物之 31 ppm濃度下展示80%與89%之間的功效：I.02；I.15；I.16；I.20；I.25；I.33；I.36；I.40；I.42；I.43；I.52；I.53；I.57。

【0208】 在此測試中，根據本發明之以下化合物在所測試化合物之 31 ppm濃度下展示90%與100%之間的功效：I.03；I.04；I.21；I.31；I.41；I.55；I.56。

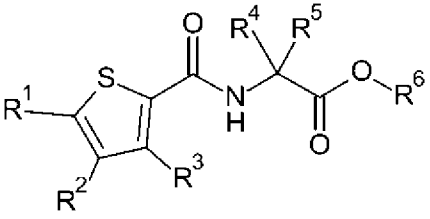
【0209】

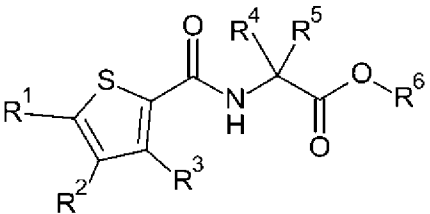
實例C：比較實例

化合物CMP3、CMP4、CMP5及CMP6在活體內預防性測試中在與實例B中所描述相同之條件中對野油菜黃單胞菌野油菜致病變種(對甘藍菜之黑腐病)進行測試。

【0210】 根據US 5,534,541教示來製備化合物CMP3、CMP4、CMP5及CMP6。

【0211】 結果如下表中所展示。

							
實例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	功效(%)
CMP3*	Br	Br	Br	異丙基	H	Et	33
I.04	Br	Br	Me	異丙基	H	Et	>90

							
實例	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	功效(%)
CMP4	Br	Br	H	H	H	Et	0
I.02	Br	Br	Me	H	H	Et	>80
CMP5*	Br	Br	H	甲基	H	H	0
I.79	Br	Br	Me	甲基	H	H	>70
CMP6*	Br	Br	H	2-甲基丙基	H	H	15
I.90	Br	Br	Me	2-甲基丙基	H	H	>70

*S鏡像異構體

【0212】

實例D：擬南芥(Arabidopsis thaliana)中防禦基因表現之誘導

使含有連接至PR1 (病原性相關蛋白I)基因(AT2G14610)之水楊酸鹽反應性啟動子序列的綠色螢光蛋白(green fluorescent protein ; GFP)之編碼序列的擬南芥報導子植物生長五天且接著經化合物噴灑。在噴灑後第3天，用來自Leica Microsystems (Wetzlar,Germany)之MacroFluo儀器評定植物螢光。用Meta-Morph Microscopy Automation & Image Analysis Software (Molecular Devices , Sunnyvale,Calif. , United States)定量螢光。

【0213】 將經模擬處理葉片之背景螢光(Background fluorescence)設定為1.00。水楊酸處理(300 ppm)產生2.70之相對螢光值，從而證明測試系統之有效性。

【0214】 在此測試中，根據本發明之以下化合物在300 ppm化合物之濃度下展示至少高於2之相對螢光值：I.01；I.03；I.04；I.05；I.06；I.07；I.08；I.09；I.11；I.13；I.16；I.19；I.20；I.21；I.23；I.24；I.26；I.29；I.30；I.32；I.33；I.35；I.36；I.37；I.39；I.43；I.46；

I.47 ; I.48 ; I.49 ; I.50 ; I.51 ; I.52 ; I.53 ; I.54 ; I.55 ; I.57 ; I.58 ;
I.59 ; I.60 ; I.61 ; I.63 ; I.64 ; I.65 ; I.66 ; I.67 ; I.68 ; I.71 ; I.72 ;
I.73 ; I.75 ; I.76 ; I.77 ; I.78 ; I.79 ; I.80 ; I.81 ; I.82 ; I.83 ; I.84 ;
I.85 ; I.86 ; I.87 ; I.88 ; I.89 ; I.90 ; I.91 。

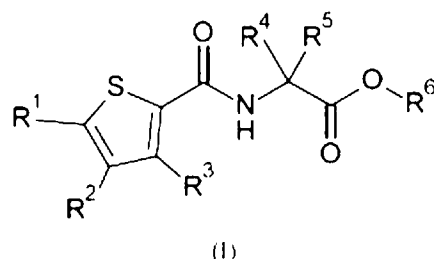
【0215】 在此測試中，根據本發明之以下化合物在75 ppm化合物之濃度下展示至少高於2之相對螢光值：I.02；I.10；I.18；I.25；I.27；I.31；I.34；I.40；I.41；I.56；I.69；I.70；I.15；I.22。

【0216】 水楊酸鹽為抵抗植物病原體之主要防禦激素。上文所描述之所有化合物刺激水楊酸途徑且因此可保護植物抵抗廣泛範圍之病原體。

【發明申請專利範圍】

【第1項】

一種式(I)化合物：



其中

R^1 及 R^2 相同且為氯原子或溴原子；

R^3 為甲基；

R^4 選自以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、芳烷基、經經基取代之芳烷基、經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 為氫原子；或

R^4 及 R^5 與其所連接之碳原子一起形成環丙基；

R^6 選自由以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -鹵烷基、 C_1 - C_6 -氰基烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_8 -環烷基、芳基、芳烷基、4員雜環基、5員雜環基或6員雜環基、 $-C_1$ - C_6 -烷基-Si(C_1 - C_6 -烷基)₃及 $-C_1$ - C_6 -烷基- C_3 - C_8 -環烷基。

【第2項】

如請求項1之式(I)化合物，其中 R^4 選自以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、苯甲基、經經基取代之苯甲基、經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 為氫原子；或 R^4 及 R^5 與其所連接之該碳原子一起形成環丙基。

【第3項】

如請求項1或2之式(I)化合物，其中 R^6 選自由以下組成之群：氫原

子、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷基、C₁-C₆-氰基烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-環烷基、苯基、苯甲基、4員雜環基、5員雜環基或6員雜環基、-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃及-C₁-C₆-烷基-環丙基。

【第4項】

如請求項1或2之式(I)化合物，其中R⁶選自由以下組成之群：氫原子、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷基、C₁-C₆-氰基烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-環烷基、苯基、苯甲基、氧雜環丁基、硫雜環丁基、二氧代硫雜環丁基、氧代環戊基、氧雜環己基、-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃及-C₁-C₆-烷基-環丙基。

【第5項】

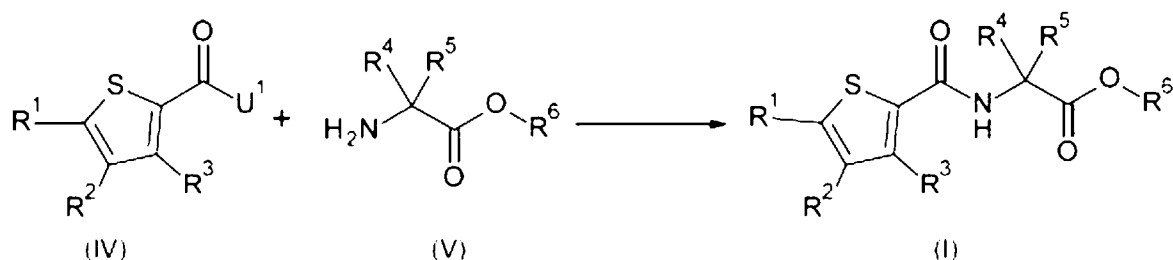
一種組合物，其包含至少一種如請求項1至4中任一項之式(I)化合物及至少一種農業上適合的助劑。

【第6項】

一種用於控制細菌性病害之方法，其包含以下步驟：將至少一種如請求項1至4中任一項之式(I)化合物或如請求項5之組合物施加至植物、植物部分、種子、果實，或植物生長之土壤。

【第7項】

一種用於製備如請求項1至4中任一項之式(I)化合物的方法，其包含使式(IV)化合物或其鹽與式(V)化合物或其鹽反應之步驟：



方法A1

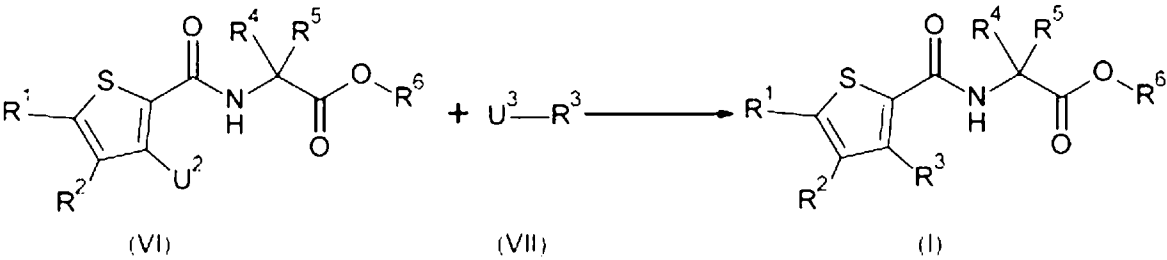
其中

R¹、R²、R³、R⁴、R⁵及R⁶如請求項1至4中所敘述；

U¹為鹵素原子、羥基或C₁-C₆-烷氧基。

【第8項】

一種用於製備如請求項1至4中任一項之式(I)化合物的方法，其包含使式(VI)化合物或其鹽與式(VII)化合物或其鹽反應之步驟：



方法B1

其中

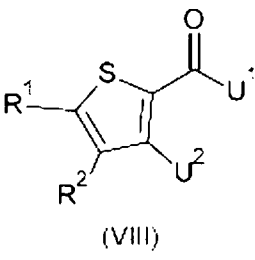
R¹、R²、R³、R⁴、R⁵及R⁶如請求項1至4中所敘述；

U²為溴原子、碘原子、甲磺酸酯基團、甲苯磺酸酯基團或三氟甲磺酸酯基團且U³為硼衍生物或鹵代金屬；

其限制條件為當R¹及R²為溴原子時，U²不為溴原子。

【第9項】

如請求項8之方法，其包含使式(VIII)化合物與如請求項7之式(V)化合物反應之步驟：



其中

R¹及R²如請求項1所敘述；

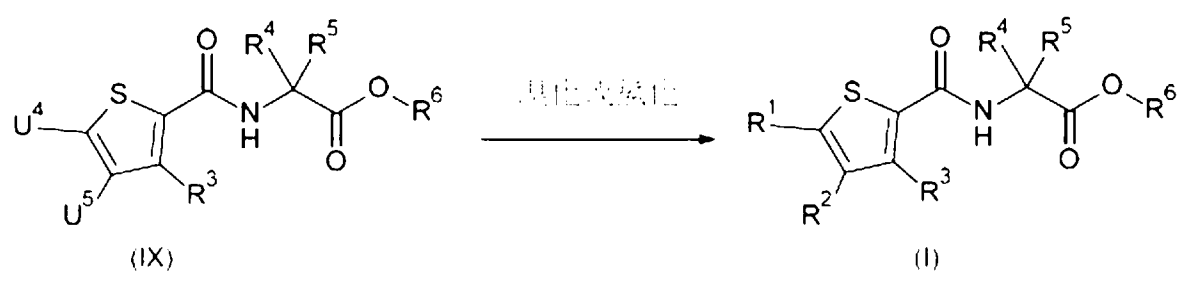
U¹為鹵素原子、羥基或C₁-C₆-烷氧基；

U²為溴原子、碘原子、甲磺酸酯基團、甲苯磺酸酯基團或三氟甲磺酸酯基團；

以提供式(VI)化合物。

【第10項】

一種用於製備如請求項1至4中任一項之式(I)化合物的方法，其包含執行式(IX)化合物或其鹽之溴化或氯化的步驟：



其中

R¹、R²、R³、R⁴、R⁵及R⁶如請求項1至4中所敘述；

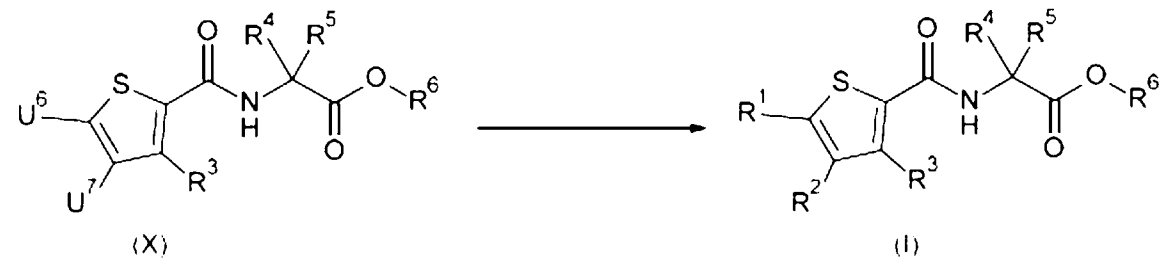
U⁴為氫原子、氯原子或溴原子；及

U⁵為氫原子、氯原子或溴原子；

其限制條件為U⁴或U⁵中之至少一者為氫原子。

【第11項】

一種用於製備如請求項1至4中任一項之式(I)化合物的方法，其包含以下步驟：執行式(X)化合物或其鹽之重氮化，隨後進行芳族取代：



方法D1

其中

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 及 R^6 如請求項1至4中所敘述；

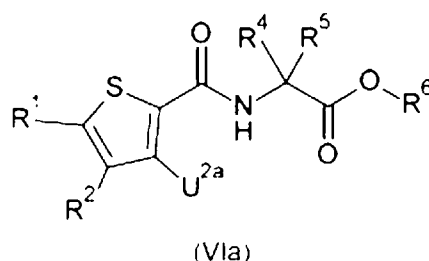
U^6 為胺基、氯原子或溴原子；

U^7 為胺基、氯原子或溴原子；

其限制條件為 U^6 或 U^7 中之至少一者為胺基。

【第12項】

一種式(VIa)化合物：



其中

R^1 及 R^2 相同且為氯原子或溴原子；

R^4 選自以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、芳烷基、經經基取代之芳烷基、經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 為氫原子；或

R^4 及 R^5 與其所連接之碳原子一起形成環丙基；

R^6 選自由以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -鹵烷基、 C_1 - C_6 -氰基烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_8 -環烷基、芳基、芳烷基、4員雜環基、5員雜環基或6員雜環基、 $-C_1$ - C_6 -烷基-Si(C_1 - C_6 -烷基)₃及 $-C_1$ - C_6 -烷基- C_3 - C_8 -環烷基；

U^{2a} 為溴原子、碘原子、甲磺酸酯基團、甲苯磺酸酯基團或三氟甲磺酸酯基團，

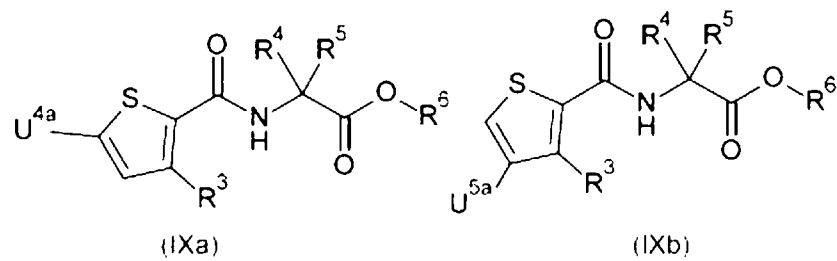
其中 R^4 選自以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、芳烷基、經經基取代之芳烷基、經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 在 R^6 為氫原

子或C₁-C₆-烷基時為氫原子；及

其限制條件為當R¹及R²為溴原子時，U^{2a}不為溴原子。

【第13項】

一種式(IXa)或(IXb)化合物：



其中

R³為甲基；

R⁴選自以下組成之群：氫原子、C₁-C₆-烷基、芳烷基、經經基取代之芳烷基、經C₁-C₆-烷基氫硫基取代之C₁-C₆-烷基，且R⁵為氫原子；或

R⁴及R⁵與其所連接之碳原子一起形成環丙基；

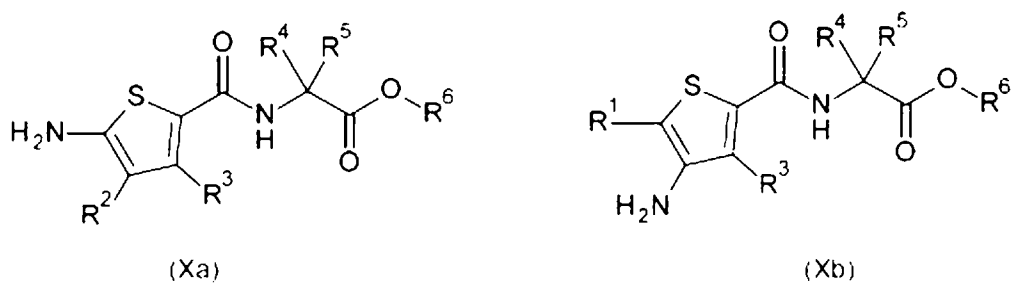
R⁶選自由以下組成之群：氫原子、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵烷基、C₁-C₆-氰基烷基、C₂-C₆-烯基、C₂-C₆-炔基、C₃-C₈-環烷基、芳基、芳烷基、4員雜環基、5員雜環基或6員雜環基、-C₁-C₆-烷基-Si(C₁-C₆-烷基)₃及-C₁-C₆-烷基-C₃-C₈-環烷基；

U^{4a}為氯原子或溴原子；及

U^{5a}為氯原子或溴原子。

【第14項】

一種式(Xa)或(Xb)化合物：



R^1 或 R^2 為氫原子或溴原子；

R^3 為甲基；

R^4 選自以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、芳烷基、經經基取代之芳烷基、經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 為氫原子；或

R^4 及 R^5 與其所連接之碳原子一起形成環丙基；

R^6 選自由以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -鹵烷基、 C_1 - C_6 -氰基烷基、 C_2 - C_6 -烯基、 C_2 - C_6 -炔基、 C_3 - C_8 -環烷基、芳基、芳烷基、4員雜環基、5員雜環基或6員雜環基、 $-C_1$ - C_6 -烷基-Si(C_1 - C_6 -烷基)₃及 $-C_1$ - C_6 -烷基- C_3 - C_8 -環烷基；

其中 R^4 選自以下組成之群：氫原子、 C_1 - C_6 -烷基、芳烷基、經經基取代之芳烷基、經 C_1 - C_6 -烷基氫硫基取代之 C_1 - C_6 -烷基，且 R^5 在 R^6 為氫原子或 C_1 - C_6 -烷基時為氫原子。