

發明專利說明書

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：97121437

C07D401/14 (2006.01)

※申請日期：97.6.9

※IPC 分類：~~C07D~~A01N

A01N 43/54 (2006.01)

A01P 3/00 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

殺真菌劑雜環基-嘧啶基-胺基衍生物

FUNGICIDE HETEROCYCLYL-PYRIMIDINYL-AMINO
DERIVATIVES

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

法商拜爾科學公司

BAYER CROPSCIENCE S.A.

代表人：(中文/英文)

卡蘿 姬藤

GUITTON, CAROLE

住居所或營業所地址：(中文/英文)

法國里昂市珍瑪麗李克蕾爾街16號

16 RUE JEAN-MARIE LECLAIR, 69009 LYON, FRANCE

國籍：(中文/英文)

法國 FRANCE

三、發明人：(共 10 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 克里斯宣 貝爾
BEIER, CHRISTIAN
2. 皮耶-維斯 科奎榮
COQUERON, PIERRE-YVES
3. 雷夫 鄧寇
DUNKEL, RALF
4. 皮耶 貞尼斯
GENIX, PIERRE
5. 喬格 葛洛
GREUL, JÖRG
6. 瑪麗-克萊兒 葛羅斯貞-康奈爾
GROSJEAN-COURNOYER, MARIE-CLAIRE
7. 艾瑪紐 希爾特
HILT, EMMANUELLE
8. 菲利浦 瑞諾斐
RINOLFI, PHILIPPE
9. 亞德 弗斯特
VOERSTE, ARND
10. 珍-皮爾 弗絲
VORS, JEAN-PIERRE

國 籍：(中文/英文)

1. 德國 GERMANY
2. 法國 FRANCE
3. 德國 GERMANY
4. 法國 FRANCE
5. 德國 GERMANY
6. 法國 FRANCE
7. 法國 FRANCE
8. 法國 FRANCE
9. 德國 GERMANY
10. 法國 FRANCE

四、聲明事項：

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

申請前已向下列國家（地區）申請專利：

【格式請依：受理國家（地區）、申請日、申請案號 順序註記】

有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1. 歐洲專利機構；2007年06月08日；07356077.3

2.

無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

1.

2.

主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

主張專利法第三十條生物材料：

須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於雜環基-嘧啶基-胺基衍生物；其製備方法；製備中間化合物；其尤其以殺真菌劑組合物之形式作為殺真菌劑活性劑之用途，及使用該等化合物或組合物控制尤其為植物之植物病原性真菌的方法。

【先前技術】

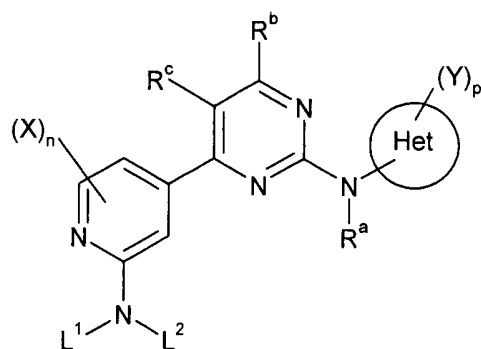
在國際專利申請案 WO 2005/019211 中，描述一些可用作殺真菌劑之具有聯芳基部分及雜環部分的化合物。即使某些該等化合物可與本發明之化合物具有結構類似性，但此文獻並未揭示亦未暗示本發明之化合物。

此外，已於國際專利申請案 WO 2004/065378 中揭示 4-[2-(乙基胺基)-4-吡啶基]-N-[5-(1-哌嗪基)-2-吡啶基]-2-嘧啶胺，其可適用作細胞增殖抑制劑。已將此化合物自本發明之範疇中排除。

在農業中，使用新穎殺蟲劑化合物來避免或控制對活性成份具有抗性之菌株的出現始終受到高度關注。以在維持至少與已知化合物相等之有效性的同時減少所用活性化合物之量為目標，使用比彼等已知化合物更具活性之新穎化合物亦受到高度關注。吾人現已發現具有上述效應或優點之新化合物家族。

【發明內容】

因此，本發明提供式 (I) 之雜環基-嘧啶基-胺基衍生物：



其中：

- Het表示包含至多四個可相同或不同之雜原子的飽和或不飽和，芳族或非芳族4、5、6或7員雜環；
- Y獨立地表示鹵素原子、硝基、羥基、側氧基、氰基、胺基、次磺醯基、五氟- λ^6 -次磺醯基、甲醯基、甲醯氧基、甲醯基胺基、胺甲醯基、N-羥基胺甲醯基、胺基甲酸酯基、(羥基亞胺基)- C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_8 烷基、三(C_1 - C_8 烷基)矽烷基、經取代或未經取代之三(C_1 - C_8 烷基)矽烷基- C_1 - C_8 烷基、經取代或未經取代之 C_1 - C_8 環烷基、經取代或未經取代之三(C_1 - C_8 烷基)矽烷基- C_1 - C_8 環烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 鹵代環烷基、 C_2 - C_8 烯基、 C_2 - C_8 炔基、 C_2 - C_8 烯氧基、 C_2 - C_8 炔氧基、 C_1 - C_8 烷基胺基、二 C_1 - C_8 烷基胺基、 C_1 - C_8 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 鹵代烷氧基、 C_1 - C_8 烷基次磺醯基、具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_8 鹵代烷基次磺醯基、 C_2 - C_8 烯氧基、具有1至5個鹵素原子之 C_2 - C_8 鹵代烯氧基、 C_3 - C_8 炔氧基、具有1至5個鹵素原子之 C_3 - C_8 鹵代炔氧基、 C_1 - C_8 烷基羰基、具有

1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基羰基、 C_1-C_8 烷基胺甲醯基、二 C_1-C_8 烷基胺甲醯基、 $N-C_1-C_8$ 烷氧基胺甲醯基、 C_1-C_8 烷氧基胺甲醯基、 $N-C_1-C_8$ 烷基- C_1-C_8 烷氧基胺甲醯基、 C_1-C_8 烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷氧基羰基、 C_1-C_8 烷基羰氧基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基羰氧基、 C_1-C_8 烷基羰基胺基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基羰基胺基、 C_1-C_8 烷基胺基羰氧基、二 C_1-C_8 烷基胺基羰氧基、 C_1-C_8 烷氧基羰氧基、 C_1-C_8 烷基次磺醯基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基次磺醯基、 C_1-C_8 烷基亞磺醯基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基亞磺醯基、 C_1-C_8 烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基磺醯基、 C_1-C_8 烷基胺基胺磺醯基、二 C_1-C_8 烷基胺基胺磺醯基、 $(C_1-C_6$ 烷氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、 $(C_1-C_6$ 烯氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、 $(C_1-C_6$ 炔氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、2-側氧基吡咯啉-1-基、經取代或未經取代之(苄氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷氧基烷基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷氧基烷基、經取代或未經取代之苄氧基、經取代或未經取代之苄基次磺醯基、經取代或未經取代之苄基胺基、經取代或未經取代之苄氧基、經取代或未經取代之苄基次磺醯基或經取代或未經取代之苄基胺基；

- p表示0、1、2、3、4、5或6；
- R^a 表示氫原子、氟基、甲醯基、甲醯氧基、 C_1-C_8 烷氧

基羰基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷氧基羰基、 C_1-C_8 烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基羰基、 C_1-C_8 烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基磺醯基、 C_1-C_8 烷基、 C_1-C_8 環烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代環烷基、 C_2-C_8 烯基、 C_2-C_8 炔基、 C_1-C_8 烷氧基烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷氧基烷基；

- R^b 及 R^c 獨立地表示氫原子、鹵素原子、氰基、 C_1-C_8 烷基、 C_1-C_8 環烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代環烷基；
- X獨立地表示 C_1-C_{10} 烷基、 C_1-C_{10} 鹵代烷基、鹵素原子或氰基；
- n表示0、1、2或3；
- L^1 及 L^2 獨立地表示氫原子、氰基、羥基、胺基、甲醯基、甲醯氧基、甲醯基胺基、胺甲醯基、N-羥基胺甲醯基、胺基甲酸酯基、經取代或未經取代之(羥基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基、三(C_1-C_8 烷基)矽烷基、經取代或未經取代之三(C_1-C_8 烷基)矽烷基- C_1-C_8 烷基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 環烷基、經取代或未經取代之三(C_1-C_8 烷基)矽烷基- C_1-C_8 環烷基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代環烷基、 C_2-C_8 烯基、經取代或未經取代之 C_2-C_8 炔

基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基胺基、經取代或未經取代之二 C_1-C_8 烷基胺基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷氧基、經取代或未經取代之 C_2-C_8 烯氧基、經取代或未經取代之 C_2-C_8 炔氧基、經取代或未經取代之 C_2-C_8 烯氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_2-C_8 鹵代烯氧基、經取代或未經取代之 C_3-C_8 炔氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_3-C_8 鹵代炔氧基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基羰基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基胺甲醯基、經取代或未經取代之二 C_1-C_8 烷基胺甲醯基、經取代或未經取代之 $N-C_1-C_8$ 烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之 $N-C_1-C_8$ 烷基- C_1-C_8 烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷氧基羰基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基羰氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基羰氧基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基羰基胺基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基羰基胺基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基胺基羰氧基、經取代或未經取代之二 C_1-C_8 烷基胺基羰氧基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷氧基羰氧基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基次磺醯基、具有1至5個

鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基次磺醯基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基亞磺醯基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基亞磺醯基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基磺醯基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基胺基胺磺醯基、經取代或未經取代之二 C_1-C_8 烷基胺基胺磺醯基、經取代或未經取代之(C_1-C_6 烷氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、經取代或未經取代之(C_1-C_6 烯氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、經取代或未經取代之(C_1-C_6 炔氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、(2-側氧基吡咯啉-1-基) C_1-C_8 烷基、具有1至5個鹵素原子之(2-側氧基吡咯啉-1-基) C_1-C_8 鹵代烷基、(2-側氧基哌啉-1-基) C_1-C_8 烷基、具有1至5個鹵素原子之(2-側氧基哌啉-1-基) C_1-C_8 鹵代烷基、(2-側氧基氮雜環庚烷-1-基) C_1-C_8 烷基、具有1至5個鹵素原子之(2-側氧基氮雜環庚烷-1-基) C_1-C_8 鹵代烷基、經取代或未經取代之(苄氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基；

- L^1 與 L^2 可共同形成包含至多4個獨立地選自由N、O、S組成之清單之雜原子的飽和或不飽和、芳族或非芳族、經取代或未經取代之4、5、6或7員包括N之雜環；

以及其鹽、N-氧化物、金屬錯合物、類金屬錯合物及光學活性或幾何異構體；其限制條件為排除以下化合物：4-[2-(乙基胺基)-4-吡啶基]-N-[5-(-哌嗪基)-2-吡啶基]-2-嘓啉胺。

視化合物中之不對稱中心數目而定，本發明化合物中之任一者均可以一或多種光學或對掌性異構形式存在。因此，本發明等效地係關於所有光學異構體且係關於其任何外消旋或非外消旋性(scalemic)混合物(術語"非外消旋性"表示不同比例之對映異構體混合物)且係關於任何比例之任何可能立體異構體的混合物。非對映異構體或光學異構體可由一般熟習此項技術者根據本身已知之任何方法來分離。

視化合物內之雙鍵數目而定，本發明化合物中之任一者亦可以一或多種幾何異構形式存在。因此，本發明等效地係關於任何幾何異構體且係關於任何比例之其任何可能混合物。幾何異構體可由一般熟習此項技術者根據本身已知之任何方法來分離。

本發明之任何式(I)化合物(其中Y表示羥基、次磺醯基或胺基)可以分別由該羥基、次磺醯基或胺基之質子移位所產生之互變異構形式存在。該等互變異構形式亦為本發明之部分。一般而言，任何互變異構形式之本發明之式(I)化合物(其中Y表示羥基、次磺醯基或胺基)以及可視情況在根據本發明之製備方法中用作中間物之互變異構形式化合物亦為本發明之部分。

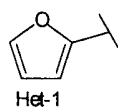
根據本發明，以下通用術語一般以以下含義使用：

- 鹵素意謂氟、氯、溴或碘；
- 雜原子可為氮、氧或硫；
- 除非另外指示，根據本發明經取代之基團或取代基可為

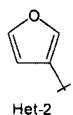
直鏈或支鏈，以及由以下基團或原子中之一或多者取代：鹵素原子、硝基、羥基、氰基、胺基、次磺醯基、五氟- λ^6 -次磺醯基、甲醯基、甲醯氧基、甲醯基胺基、胺甲醯基、N-羥基胺甲醯基、胺基甲酸酯基、(羥基亞胺基)-C₁-C₆烷基、C₁-C₈烷基、三(C₁-C₈烷基)矽烷基-C₁-C₈烷基、C₁-C₈環烷基、三(C₁-C₈烷基)矽烷基-C₁-C₈環烷基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代環烷基、C₂-C₈烯基、C₂-C₈炔基、C₂-C₈烯氧基、C₂-C₈炔氧基、C₁-C₈烷基胺基、二C₁-C₈烷基胺基、C₁-C₈烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷氧基、C₁-C₈烷基次磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷基次磺醯基、C₂-C₈烯氧基、具有1至5個鹵素原子之C₂-C₈鹵代烯氧基、C₃-C₈炔氧基、具有1至5個鹵素原子之C₃-C₈鹵代炔氧基、C₁-C₈烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷基羰基、C₁-C₈烷基胺甲醯基、二C₁-C₈烷基胺甲醯基、N-C₁-C₈-烷氧基胺甲醯基、C₁-C₈烷氧基胺甲醯基、N-C₁-C₈烷基-C₁-C₈烷氧基胺甲醯基、C₁-C₈烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷氧基羰基、C₁-C₈烷基羰氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷基羰氧基、C₁-C₈烷基羰基胺基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷基羰基胺基、C₁-C₈烷基胺基羰氧基、二C₁-C₈烷基胺基羰氧基、C₁-C₈烷氧基羰氧基、C₁-C₈烷基次磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷基次磺醯基、C₁-C₈烷基亞磺醯基、

具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基亞磺醯基、 C_1-C_8 烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基磺醯基、 C_1-C_8 烷基胺基胺磺醯基、二 C_1-C_8 烷基胺基胺磺醯基、(C_1-C_6 烷氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、(C_1-C_6 烯氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、(C_1-C_6 炔氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、2-側氧基吡咯啉-1-基、(苄氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、 C_1-C_8 烷氧基烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷氧基烷基、苄氧基、苄基次磺醯基、苄基胺基、苯氧基、苯基次磺醯基或苯基胺基。

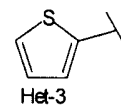
本發明之較佳式(I)化合物為其中Het表示選自由以下各基組成之清單之飽和或不飽和、芳族或非芳族雜環的彼等化合物：



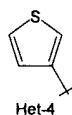
;



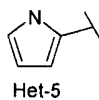
;



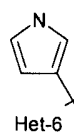
;



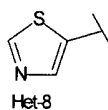
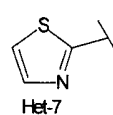
;



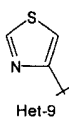
;



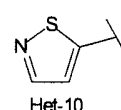
;



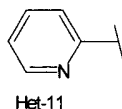
;



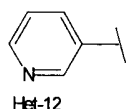
;



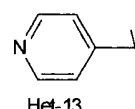
;



;



;



本發明之其他較佳式(I)化合物為其中Y表示以下各基之彼等化合物：鹵素原子、氟基、甲醯基胺基、胺甲醯基、

經取代或未經取代之(羥基亞胺基)-C₁-C₆烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷基、經取代或未經取代之三(C₁-C₈烷基)矽烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈環烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代烷氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷基羰基胺基。更佳地，Y表示鹵素原子、氰基、甲醯基胺基、胺甲醯基、經取代或未經取代之(羥基亞胺基)-C₁-C₆烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷基、經取代或未經取代之三(C₁-C₈烷基)矽烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈環烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代烷氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代烷基。

本發明之其他較佳式(I)化合物為其中p表示0、1或2之彼等化合物。更佳地，p表示1。

本發明之其他較佳式(I)化合物為其中R^a表示氫原子之彼等化合物。

本發明之其他較佳式(I)化合物為其中R^b及R^c獨立地表示氫原子或鹵素原子之彼等化合物。更佳地，R^b及R^c表示氫原子。

本發明之其他較佳式(I)化合物為其中n表示0之彼等化合物。

本發明之其他較佳式(I)化合物為其中L¹及L²獨立地表示

以下各基之彼等化合物：氫原子、氟基、羥基、胺基、甲醯基、甲醯氧基、甲醯基胺基、經取代或未經取代之(羥基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基、三(C_1-C_8 烷基)矽烷基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 環烷基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代環烷基、 C_2-C_8 烯基、經取代或未經取代之 C_2-C_8 炔基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基胺基、經取代或未經取代之二 C_1-C_8 烷基胺基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷氧基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基羰基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基胺甲醯基、經取代或未經取代之二 C_1-C_8 烷基胺甲醯基、經取代或未經取代之 $N-C_1-C_8$ 烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之 $N-C_1-C_8$ 烷基- C_1-C_8 烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷氧基羰基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基羰氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基羰氧基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基羰基胺基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基羰基胺基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基胺基羰氧基、經取代或未經取代之二 C_1-C_8 烷基胺基羰氧基、經取代或未經取代之

C_1-C_8 烷氧基羰氧基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基磺醯基、(2-側氧基吡咯啉-1-基) C_1-C_8 烷基、具有1至5個鹵素原子之(2-側氧基吡咯啉-1-基) C_1-C_8 鹵代烷基、(2-側氧基哌啉-1-基) C_1-C_8 烷基、具有1至5個鹵素原子之(2-側氧基哌啉-1-基) C_1-C_8 鹵代烷基、(2-側氧基氮雜環庚烷-1-基) C_1-C_8 烷基、具有1至5個鹵素原子之(2-側氧基氮雜環庚烷-1-基) C_1-C_8 鹵代烷基；

當 L^1 與 L^2 共同形成包含至多4個選自由N、O、S組成之清單之雜原子的經取代或未經取代之4、5、6或7員雜環時， L^1 及 L^2 獨立地表示經取代或未經取代之2-側氧基吡咯啉-1-基或經取代或未經取代之2-側氧基-1,3-噁唑啉-3-基。

本發明之更佳式(I)化合物為其中 L^1 及 L^2 獨立地表示氫原子或直鏈或支鏈、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基，例如(C_1-C_8 烷氧基)- C_1-C_8 烷基之彼等化合物。

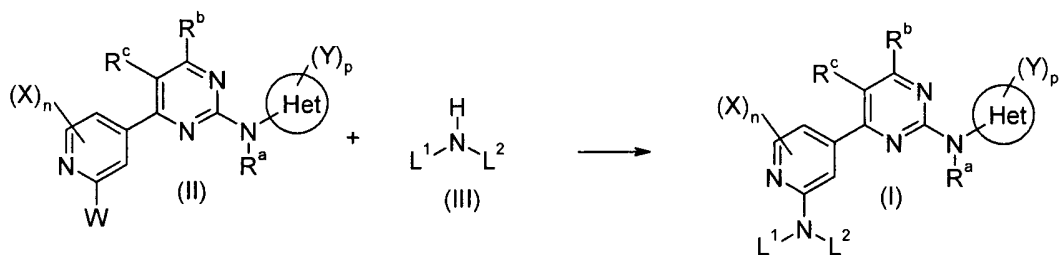
上述關於本發明之式(I)化合物之取代基的優先選擇可以各種方式(個別、部分或完全)組合。因此，該等較佳特徵組合提供本發明化合物之子類。本發明較佳化合物之該等子類實例可組合：

- Het之較佳特徵以及Y、p、 R^a 、 R^b 、 R^c 、X、n、 L^1 及 L^2 中一或多者之較佳特徵；
- Y之較佳特徵以及Het、p、 R^a 、 R^b 、 R^c 、X、n、 L^1 及 L^2 中一或多者之較佳特徵；

- p之較佳特徵以及Het、Y、R^a、R^b、R^c、X、n、L¹及L²中一或多者之較佳特徵；
- R^a之較佳特徵以及Het、Y、p、R^b、R^c、X、n、L¹及L²中一或多者之較佳特徵；
- R^b之較佳特徵以及Het、Y、p、R^a、R^c、X、n、L¹及L²中一或多者之較佳特徵；
- R^c之較佳特徵以及Het、Y、p、R^a、R^b、X、n、L¹及L²中一或多者之較佳特徵；
- X之較佳特徵以及Het、Y、p、R^a、R^b、R^c、n、L¹及L²中一或多者之較佳特徵；
- n之較佳特徵以及Het、Y、p、R^a、R^b、R^c、X、L¹及L²中一或多者之較佳特徵；
- L¹之較佳特徵以及Het、Y、p、R^a、R^b、R^c、X、n及L²中一或多者之較佳特徵；
- L²之較佳特徵以及Het、Y、p、R^a、R^b、R^c、X、n及L¹中一或多者之較佳特徵。

在本發明化合物之取代基之該等較佳特徵組合中，該等較佳特徵亦可選自Het、Y、p、R^a、R^b、R^c、X、n、L¹及L²各者之更佳特徵以形成本發明化合物之最佳子類。

本發明亦係關於一種製備式(I)化合物之方法。因此，根據本發明之另一態樣，提供一種製備如本文所定義之式(I)化合物之方法P1，如以下反應流程所說明：



方法 P1

其中：

- W 表示離去基，諸如鹵素原子、C₁-C₆烷基磺酸酯基、C₁-C₆鹵烷基磺酸酯基；經取代或未經取代之苯基磺酸酯基，且
- X、Y、n、p、R^a、R^b、R^c、L¹、L²、Het 係如本文中所定義；且包含
 - 視情況在催化劑存在下，較佳在過渡金屬催化劑(諸如銅鹽，較佳為銅(I)鹽，例如氯化銅(I)、氰化銅(I)；諸如鈇鹽或錯合物，例如氯化鈇(II)、乙酸鈇(II)、肆(三苯基膦)鈇(0)、二氯化雙(三苯基膦)鈇(II)、參(二亞苳基丙酮)二鈇(0)、雙(二亞苳基丙酮)鈇(0)或氯化1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵-鈇(II))存在下，使式(II)化合物與式(III)之胺基衍生物反應以產生式(I)化合物。或者，藉由視情況在鹼(諸如無機鹼或有機鹼；較佳為鹼土金屬或鹼金屬氫化物、氫氧化物、醯胺、醇鹽、乙酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽，諸如氫化鈉、醯胺鈉、二異丙基醯胺鋰、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鉀、乙酸鈉、乙酸鉀、乙酸鈣、氫氧化鈉、氫氧化鉀、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鈉、碳酸氫鉀、碳

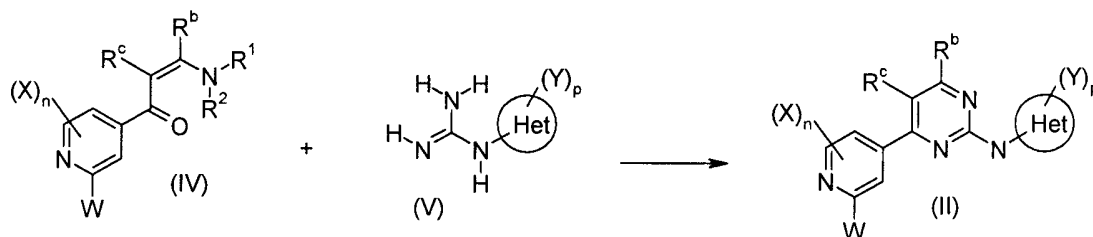
酸銨或碳酸銨；以及三級胺，諸如三甲胺、三乙胺 (TEA)、三丁胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基-苄基胺、N,N-二異丙基-乙基胺 (DIPEA)、吡啶、N-甲基吡啶、N-甲基嗎啉、N,N-二甲基胺基吡啶、二氮雜雙環辛烷 (DABCO)、二氮雜雙環壬烯 (DBN) 或二氮雜雙環十一烯 (DBU)) 存在下，獨立地向反應混合物中添加鈹鹽及錯合物配位體 (諸如膦，例如三乙基膦、三第三丁基膦、三環己基膦、2-(二環己基膦)聯苯、2-(二第三丁基膦)聯苯、2-(二環己基膦)-2'-(N,N-二甲基胺基)-聯苯、三苯基膦、參(鄰甲苯基)膦、3-(二苯基膦基)苯磺酸鈉、參-2-(甲氧基苯基)膦、2,2'-雙-(二苯基膦)-1,1'-聯苯、1,4-雙-(二苯基膦)丁烷、1,2-雙-(二苯基膦)乙烷、1,4-雙-(二環己基膦)丁烷、1,2-雙-(二環己基膦)乙烷、2-(二環己基膦)-2'-(N,N-二甲基胺基)-聯苯、雙(二苯基膦基)二茂鐵、參(2,4-第三丁基苯基)-亞磷酸鹽、(R)-(-)-1-[(S)-2-(二苯基膦基)二茂鐵基]乙基二第三丁基膦、(S)-(+)-1-[(R)-2-(二苯基膦基)二茂鐵基]乙基二環己基膦、(R)-(-)-1-[(S)-2-(二苯基膦基)二茂鐵基]乙基二環己基膦、(S)-(+)-1-[(R)-2-(二苯基膦基)二茂鐵基]乙基二第三丁基膦)而於該反應混合物中直接產生鈹錯合物。

視 X、Y、n、p、R^a、R^b、R^c、Het 之各自定義而定，式 (II) 之胺基-嘓啶衍生物可藉由各種方法來製備。

因此，提供一種製備式 (II) 化合物之本發明方法 A，其

中：

- R^a 表示氫原子；
 - X 、 Y 、 n 、 p 、 R^b 、 R^c 、 Het 係如本文中所定義，且包含：
- 根據反應流程 A-1 之第一步驟：



流程 A-1

其中：

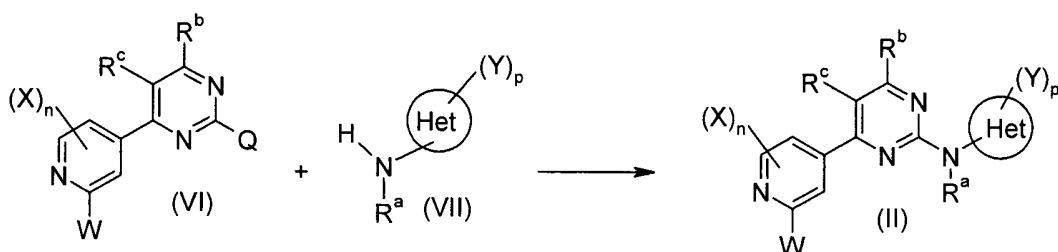
- W 、 X 、 Y 、 n 、 p 、 R^b 、 R^c 、 Het 係如本文中所定義；
- R^1 及 R^2 獨立地為 C_1 - C_8 烷基， R^1 與 R^2 可共同形成包含至多 4 個選自由 N 、 O 、 S 組成之清單之雜原子的經取代或未經取代之 4、5、6 或 7 員雜環；

其包含在 -50°C 至 200°C 之溫度下，視情況在鹼（諸如無機鹼或有機鹼，較佳為鹼土金屬或鹼金屬氫化物、氫氧化物、醯胺、醇鹽、乙酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽，諸如氫化鈉、醯胺鈉、二異丙基醯胺鋰、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鉀、乙酸鈉、乙酸鉀、乙酸鈣、氫氧化鈉、氫氧化鉀、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鉀、碳酸氫鈉、碳酸銫或碳酸銨；以及三級胺，諸如三甲胺、三乙胺 (TEA)、三丁胺、 N,N -二甲基苯胺、 N,N -二甲基-苄基胺、 N,N -二異丙基-乙基胺 (DIPEA)、吡啶、 N -甲基哌啶、 N -甲基嗎啉、 N,N -二甲基

胺基吡啶、二氮雜雙環辛烷(DABCO)、二氮雜雙環壬烯(DBN)或二氮雜雙環十一烯(DBU))存在下，藉由使式(IV)化合物與式(V)之胍或胍鹽衍生物縮合形成嘓啶部分以產生式(II)化合物。

或者，提供一種製備式(II)化合物之本發明方法B，其中W、X、Y、n、p、R^a、R^b、R^c、Het係如本文中所定義，且包含：

- 根據反應流程B-1之第一步驟：



流程 B-1

其中：

- W、X、Y、n、p、R^a、R^b、R^c、Het係如本文中所定義；
- Q表示氫原子或離去基，諸如鹵素原子、C₁-C₆烷基次磺醯基、C₁-C₆鹵烷基次磺醯基；經取代或未經取代之苯基次磺醯基、C₁-C₆烷基磺醯基、C₁-C₆鹵烷基磺醯基；經取代或未經取代之苯基磺醯基，且其包含：

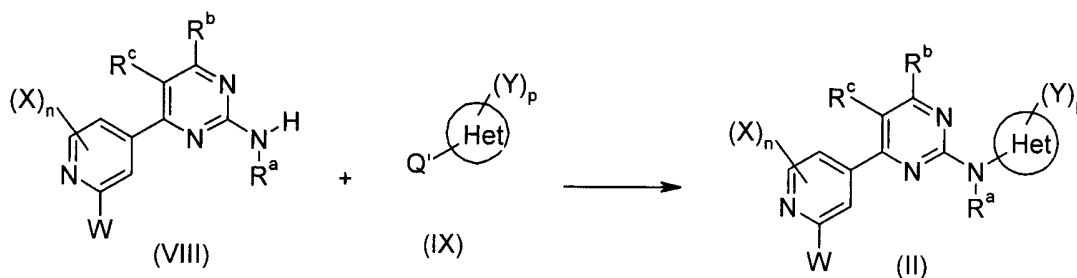
視情況在催化劑，較佳為過渡金屬催化劑(諸如鈀鹽或錯合物，例如氯化鈀(II)、乙酸鈀(II)、肆(三苯基膦)鈀(0)、二氯化雙-(三苯基膦)鈀(II)、參(二亞苄基丙酮)二鈀(0)、雙(二亞苄基丙酮)鈀(0)或二氯化1,1'-雙(二苯基膦基)

二茂鐵-鈀(II))存在下，使式(VI)化合物與式(VII)之胺基衍生物反應以產生式(II)化合物。或者，藉由視情況在有機金屬試劑(諸如有機鋰試劑，例如正丁基鋰、甲基鋰、苯基鋰或有機鹵化鎂試劑(格林納試劑(Grignard reagent))，諸如鹵化異丙基鎂，更佳地諸如氯化異丙基鎂)存在下，視情況在鹼(諸如無機鹼或有機鹼，較佳為鹼土金屬或鹼金屬氫化物、氫氧化物、醯胺、醇鹽、乙酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽，諸如氫化鈉、醯胺鈉、二異丙基醯胺鋰、氯化2,2,6,6-四甲基哌啶基鎂、雙(三甲基矽烷)胺基鋰(lithium hexamethyldisilazide)、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鉀、乙酸鈉、乙酸鉀、乙酸鈣、氫氧化鈉、氫氧化鉀、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鉀、碳酸氫鈉、碳酸鈾或碳酸銨；以及三級胺，諸如三甲胺、三乙胺(TEA)、三丁胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基-苄基胺、N,N-二異丙基-乙基胺(DIPEA)、吡啶、N-甲基哌啶、N-甲基嗎啉、N,N-二甲基胺基吡啶、二氮雜雙環辛烷(DABCO)、二氮雜雙環壬烯(DBN)或二氮雜雙環十一烯(DBU))存在下，視情況在金屬鹽(諸如鹼土金屬鹽、鹼金屬鹽；過渡金屬鹽，諸如鋰鹽，較佳為鹵化鋰，更佳為氯化鋰，諸如銅鹽，較佳為銅(I)鹽，諸如氯化銅(I)、氰化銅(I))存在下，在氧化劑(諸如氧、3,3',5,5'-四-第三丁基二苯酚合苯醌、2,3-二氯-5,6-二氯基-1,4-苯醌(DDQ)及2,3,5,6-四氯-1,4-苯醌(四氯代苯醌))存在下，獨立地向反應混合物中添加鈀鹽及錯合物配位體(諸如膦，例如三乙基膦、三第三丁基膦、三環己基膦、2-

(二環己基膦)聯苯、2-(二第三丁基膦)聯苯、2-(二環己基膦)-2'-(N,N-二甲基胺基)-聯苯、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)-1,1'-聯苯、1,4-雙-(二苯基膦)丁烷、1,2-雙-(二苯基膦)乙烷、1,4-雙-(二環己基膦)丁烷、1,2-雙-(二環己基膦)乙烷、2-(二環己基膦)-2'-(N,N-二甲基胺基)-聯苯、雙(二苯基膦基)二茂鐵、參-(2,4-第三丁基苯基)-亞磷酸鹽、(R)-(-)-1-[(S)-2-(二苯基膦基)二茂鐵基]乙基二第三丁基膦、(S)-(+)-1-[(R)-2-(二苯基膦基)二茂鐵基]乙基二環己基膦、(R)-(-)-1-[(S)-2-(二苯基膦基)二茂鐵基]乙基二環己基膦、(S)-(+)-1-[(R)-2-(二苯基膦基)二茂鐵基]乙基二第三丁基膦)而於該反應混合物中直接產生鈮錯合物。

或者，提供一種製備式(II)化合物之本發明方法C，其中W、X、Y、n、p、R^a、R^b、R^c、Het係如本文中所定義，且包含：

- 根據反應流程C-1之第一步驟：



流程 C-1

其中：

- W、X、Y、n、p、R^a、R^b、R^c、Het係如本文中所定義；

- Q'表示離去基，諸如鹵素原子、C₁-C₆烷基次磺醯基、C₁-C₆鹵烷基次磺醯基；經取代或未經取代之苯基次磺醯基、C₁-C₆烷基磺酸酯基、C₁-C₆鹵烷基磺酸酯基；經取代或未經取代之苯基磺酸酯基，且其包含：

視情況在催化劑，較佳為過渡金屬催化劑(諸如鈀鹽或錯合物，例如氯化鈀(II)、乙酸鈀(II)、肆-(三苯基膦)鈀(0)、二氯化雙-(三苯基膦)鈀(II)、參(二亞苳基丙酮)二鈀(0)、雙(二亞苳基丙酮)鈀(0)或氯化1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵-鈀(II))存在下，使式(VIII)之胺基衍生物與式(IX)化合物反應以產生式(II)化合物。或者，藉由視情況在有機金屬試劑(諸如有機鋰試劑，例如正丁基鋰、甲基鋰、苯基鋰或有機鹵化鎂試劑(格林納試劑)，諸如鹵化異丙基鎂，例如氯化異丙基鎂)存在下，視情況在鹼(諸如無機鹼或有機鹼；較佳為鹼土金屬或鹼金屬氫化物、氫氧化物、醯胺、醇鹽、乙酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽，諸如氫化鈉、醯胺鈉、二異丙基醯胺鋰、氯化2,2,6,6-四甲基哌啶基鎂、雙(三甲基矽烷)胺基鋰、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鉀、乙酸鈉、乙酸鉀、乙酸鈣、氫氧化鈉、氫氧化鉀、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鉀、碳酸氫鈉、碳酸鈹或碳酸銨；以及三級胺，諸如三甲基胺、三乙基胺(TEA)、三丁基胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基-苳基胺、N,N-二異丙基-乙基胺(DIPEA)、吡啶、N-甲基哌啶、N-甲基嗎啉、N,N-二甲基胺基吡啶、二氮雜雙環辛烷(DABCO)、二氮雜雙環壬烯(DBN)或二氮雜雙環十一烯(DBU))存在下，視情

況在金屬鹽(諸如鹼土金屬鹽、鹼金屬鹽；過渡金屬鹽，諸如鋰鹽，較佳為鹵化鋰，更佳為氯化鋰，諸如銅鹽，較佳為銅(I)鹽，諸如氯化銅(I)，氰化銅(I))存在下，在氧化劑(諸如氧、3,3',5,5'-四-第三丁基二苯酚合苯醌、2,3-二氯-5,6-二氰基-1,4-苯醌(DDQ)及2,3,5,6-四氯-1,4-苯醌(四氯代苯醌))存在下，獨立地向反應混合物中添加鈮鹽及錯合物配位體(諸如膦，例如三乙基膦、三第三丁基膦、三環己基膦、2-(二環己基膦)聯苯、2-(二第三丁基膦)聯苯、2-(二環己基膦)-2'-(N,N-二甲基胺基)-聯苯、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)-1,1'-聯苯、1,4-雙-(二苯基膦)丁烷、1,2-雙-(二苯基膦)乙烷、1,4-雙-(二環己基膦)丁烷、1,2-雙-(二環己基膦)乙烷、2-(二環己基膦)-2'-(N,N-二甲基胺基)-聯苯、雙(二苯基膦基)二茂鐵、參-(2,4-第三丁基苯基)-亞磷酸鹽、(R)-(-)-1-[(S)-2-(二苯基膦基)二茂鐵基]乙基二第三丁基膦、(S)-(+)-1-[(R)-2-(二苯基膦基)二茂鐵基]乙基二環己基膦、(R)-(-)-1-[(S)-2-(二苯基膦基)二茂鐵基]乙基二環己基膦、(S)-(+)-1-[(R)-2-(二苯基膦基)二茂鐵基]乙基二第三丁基膦)而於該反應混合物中直接產生鈮錯合物。

在各情況下，用於進行本發明之方法P1、A、B及C之合適溶劑為所有慣用惰性有機溶劑。較佳為使用視情況經鹵化之脂族、脂環族或芳族烴類，諸如石油醚、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；醚類，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、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或大茴香醚；腈類，諸如乙腈、丙腈、正丁腈或異丁腈或苯甲腈；醯胺類，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酸三醯胺；酯類，諸如乙酸甲酯或乙酸乙酯；亞砒類，諸如二甲亞砒；或砒類，諸如環丁砒。

當進行本發明之方法P1、A、B及C時，反應溫度可在相對廣泛範圍內獨立變化。一般而言，本發明之方法係在-80°C與250°C之間之溫度下進行。

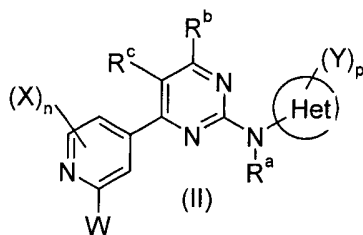
本發明之方法P1、A、B及C一般係在大氣壓下獨立地進行。然而，在各情況下，亦可能在高壓或減壓下進行。

藉由慣用方法進行處理。一般而言，將反應混合物以水處理且將有機相分開且在乾燥後於減壓下濃縮。若適當，則可藉由慣用方法(諸如層析或再結晶)使剩餘殘餘物脫除仍可存在之任何雜質。

可根據上述方法製備本發明之化合物。然而，應瞭解熟習此項技術者基於其一般知識及可獲得之公開案將能夠根據所需合成之本發明化合物各自之特異性來調適該等方法。

在另一態樣中，本發明係關於適用作用於本發明之製備方法之中間化合物或材料的式(II)化合物。

因此，本發明提供式(II)化合物：



其中：

- W表示離去基，諸如鹵素原子、C₁-C₆烷基磺酸酯基、C₁-C₆鹵烷基磺酸酯基；經取代或未經取代之苯基磺酸酯基，且
- X、Y、n、p、R^a、R^b、R^c、Het係如本文中所定義。

在另一態樣中，本發明亦係關於一種包含有效且無植物毒性量之式(I)活性化合物的殺真菌劑組合物。

表述"有效且無植物毒性量"意謂足以控制或破壞存在或傾向於出現在作物上之真菌且不引起該等作物之任何可感知之植物毒性症狀的本發明組合物之量。該量可視待控制之真菌、作物類型、氣候條件及本發明之殺真菌劑組合物中所包括之化合物而於廣泛範圍內變化。此量可藉由系統性現場試驗來測定，該等試驗在熟習此項技術者之能力範圍內。

因此，根據本發明，提供一種包含作為活性成份之有效量之如本文所定義之式(I)化合物，及農業上可接受之載體、載劑或填充劑的殺真菌劑組合物。

根據本發明，術語"載體"表示與式(I)之活性化合物組合或締合以使其易於施用(尤其)至植物部分之天然或合成、有機或無機化合物。因此，此載體一般為惰性的且應為農

業上可接受的。載體可為固體或液體。合適載體之實例包括黏土、天然或合成矽酸鹽、二氧化矽、樹脂、蠟、固體肥料、水、醇(尤其為丁醇)、有機溶劑、礦物油及植物油及其衍生物。亦可使用該等載體之混合物。

本發明之組合物亦可包含其他組份。詳言之，組合物可另外包含界面活性劑。界面活性劑可為離子型或非離子型乳化劑、分散劑或濕潤劑，或該等界面活性劑之混合物。例如，可提及聚丙烯酸鹽、木質磺酸鹽、酚磺酸鹽或萘磺酸鹽、氧化乙烯與脂肪醇或脂肪酸或脂肪胺之聚縮合物、經取代之酚類(尤其為烷基酚或芳基酚)、磺基丁二酸酯之鹽、牛磺酸衍生物(尤其為牛磺酸烷基酯)、聚氧乙烯化醇或酚之磷酸酯、多元醇之脂肪酸酯及含有硫酸根、磺酸根及磷酸根官能基之上述化合物的衍生物。當活性化合物及/或惰性載體不溶於水時且當施用之媒介劑為水時，一般必需存在至少一種界面活性劑。較佳地，界面活性劑含量可佔組合物之5重量%至40重量%。

視情況，亦可包括其他組份，例如保護性膠體、黏著劑、增稠劑、流動減黏劑、穿透劑、穩定劑、螯合劑。更一般而言，可遵照常見調配技術將活性化合物與任何固體或液體添加劑組合。

一般而言，本發明之組合物可含有0.05至99重量%，較佳10至70重量%之活性化合物。

本發明之組合物可以各種形式使用，諸如氣霧劑施配器、膠囊懸浮液、冷霧濃縮物、粉劑、可乳化濃縮物、水

包油乳液、油包水乳液、囊封顆粒、細顆粒劑、用於種子處理之可流動濃縮物、氣體(在壓力下)、產生氣體之產品、顆粒、熱霧濃縮物、大粒劑、微粒劑、油分散性粉末、可與油混溶之可流動濃縮物、可與油混溶之液體、糊狀物、藥簽劑、用於乾式種子處理之粉末、以殺蟲劑塗佈之種子、可溶性濃縮物、可溶性粉末、用於種子處理之溶液、懸浮液濃縮物(可流動濃縮物)、超低體積(ULV)液體、超低體積(ULV)懸浮液、水分散性顆粒或錠劑、用於漿料處理之水分散性粉末、水溶性顆粒或錠劑、用於種子處理之水溶性粉末及可濕潤粉末。該等組合物不僅包括現成可施用於待藉助於合適裝置(諸如噴霧或灑粉裝置)處理之植物或種子的組合物，且亦包括必須在施用於作物之前稀釋之濃縮商業組合物。

亦可將本發明之化合物與一或多種殺昆蟲劑、殺真菌劑、殺菌劑、引誘劑、殺蟎劑或信息素活性物質或具有生物活性之其他化合物混合。如此獲得之混合物通常具有增寬之活性範圍。與其他殺真菌劑化合物之混合物特別有利。

合適殺真菌劑混合搭配物之實例可選自以下清單：

B1) 能夠抑制核酸合成之化合物，如苯霜靈(benalaxyl)、苯霜靈-M(benalaxyl-M)、布瑞莫(bupirimate)、奇拉仙(chiralaxyl)、克羅拉肯(clozylacon)、二甲嘧吩(dimethirimol)、乙菌啞(ethirimol)、呋霜靈(furalaxyl)、噁黴靈(hymexazol)、滅達樂-M(metalaxyl-

M)、呋喃胺(ofurace)、歐殺斯(oxadixyl)、噁喹酸(oxolinic acid)；

B2)能夠抑制有絲分裂及細胞分裂之化合物，如苯菌靈(benomyl)、貝芬替(carbendazim)、乙徽威(diethofencarb)、麥穗靈(fuberidazole)、賓克隆(pencycuron)、噻苯咪唑(thiabendazole)、甲基硫菌靈(thiophanate-methyl)、氣苯醯胺(zoxamide)；

B3)能夠抑制呼吸作用之化合物，例如：

CI-呼吸抑制劑，如氟嘧菌胺(diflumetorim)；

CII-呼吸抑制劑，如博克利(boscalid)、萎鏽靈(carboxin)、甲呋喃胺(fenfuram)、氟多寧(flutolanil)、福拉比(furametpyr)、滅鏽胺(mepronil)、氧化萎鏽靈(oxycarboxin)、吡噻菌胺(penthiopyrad)、賽氟滅(thifluzamide)；

CII呼吸抑制劑，如亞托敏(azoxystrobin)、賽座滅(cyazofamid)、地莫菌胺(dimoxystrobin)、烯肱菌酯(enestrobin)、噁唑菌酮(famoxadone)、咪唑菌酮(fenamidone)、氟氧菌胺(fluxastrobin)、醚菌酯(kresoxim-methyl)、苯氧菌胺(metominostrobin)、奧瑞菌胺(oryastrobin)、百克敏(pyraclostrobin)、啞氧菌胺(picoxystrobin)、三氟敏(trifloxystrobin)；

B4)能夠用作解偶聯劑之化合物，如白粉克(dinocap)、扶吉胺(fluzinam)；

B5)能夠抑制ATP產生之化合物，如三苯醋錫(fentin

acetate)、三苯錫氯(fentin chloride)、三苯基氫氧化錫(fentin hydroxide)、矽硫芬(silthiofam)；

B6)能夠抑制AA及蛋白生物合成之化合物，如胺撲滅(andoprim)、殺稻瘟菌素-S(blasticidin-S)、嘧菌環胺(cyprodinil)、春日黴素(kasugamycin)、水合鹽酸春日黴素(kasugamycin hydrochloride hydrate)、嘧菌胺(mepanipyrim)、嘧黴胺(pyrimethanil)；

B7)能夠抑制信號轉導之化合物，如拌種咯(fenpiclonil)、咯菌腈(fludioxonil)、快諾芬(quinoxifen)；

B8)能夠抑制脂質及膜合成之化合物，如乙菌利(chlozolate)、依普同(iprodione)、撲滅寧(procymidone)、免克寧(vinclozolin)、白粉松(pyrazophos)、護粒松(edifenphos)、丙基喜樂松(iprobenfos)(IBP)、稻瘟靈(isoprothiolane)、甲基立枯磷(tolclofos-methyl)、聯苯、3-碘-2-丙炔基-丁基胺基甲酸酯(iodocarb)、霜黴威(propamocarb)、鹽酸霜黴威(propamocarb-hydrochloride)；

B9)能夠抑制麥角固醇(ergosterol)生物合成之化合物，如環醯菌胺(fenhexamid)、阿紮康唑(azaconazole)、比多農(bitertanol)、溴克唑(bromuconazole)、環克唑(cyproconazole)、苜氣三唑醇(diclobutrazole)、苯醚甲環唑(difenoconazole)、二硝康唑(diniconazole)、二硝康唑-M(diniconazole-M)、氟環唑(epoxiconazole)、乙環唑(etaconazole)、芬布康唑(fenbuconazole)、氟奎康唑(fluquinconazole)、氟矽唑(flusilazole)、護汰芬

(flutriafol)、呋菌唑(furconazole)、順呋菌唑(furconazole-cis)、六康唑(hexaconazole)、亞胺唑(imibenconazole)、依普克唑(ipconazole)、葉菌唑(metconazole)、麥環丁尼(myclobutanil)、巴克素(paclobutrazol)、潘康唑(penconazole)、丙環唑(propiconazole)、丙硫醇克唑(prothioconazole)、矽氟唑(simeconazole)、得克利(tebuconazole)、氟醚唑(tetraconazole)、三泰芬(triadimefon)、三泰隆(triadimenol)、環菌唑(triticonazole)、烯效唑(uniconazole)、伏立康唑(voriconazole)、依滅列(imazalil)、硫酸依滅列(sulfate imazalil)、噁咪唑(oxpoconazole)、芬瑞莫(fenarimol)、呋嘧啉醇(flurprimidol)、氟苯嘧啉醇(nuarimol)、比芬諾(pyrifenox)、賽福寧(triforine)、稻瘟酯(pefurazoate)、撲克拉(prochloraz)、氟菌唑(triflumizole)、維尼康唑(viniconazole)、阿迪莫夫(aldimorph)、嗎菌靈(dodemorph)、乙酸嗎菌靈(dodemorph acetate)、芬普福(fenpropimorph)、十三嗎啉(tridemorph)、苯鏽啉(fenpropidin)、螺環菌胺(spiroxamine)、萘替芬(naftifine)、稗草畏(pyributicarb)、特比萘芬(terbinafine)；

B10)能夠抑制細胞壁合成之化合物，如苯噻瓦利(benthiavalicarb)、雙丙胺磷(bialaphos)、達滅芬(dimethomorph)、氟嗎啉(flumorph)、顯徽威(iprovalicarb)、多氧菌素(polyoxins)、多氧徽素

(polyoxorim)、井岡黴素A(validamycin A)；

B11)能夠抑制黑色素生物合成之化合物，如加普胺(carpropamid)、二氯西莫(diclocymet)、禾草靈(fenoxanil)、苯酞(phthalide)、百快隆(pyroquilon)、三環唑(tricyclazole)；

B12)能夠誘發宿主防禦之化合物，如酸化苯并噻二唑-S-甲酯(acibenzolar-S-methyl)、噻菌靈(probenazole)、汰敵寧(tiadinil)；

B13)能夠具有多位點作用之化合物，如四氯丹(captafol)、蓋普丹(captan)、百菌清(chlorothalonil)、銅製劑(諸如氫氧化銅、環烷酸銅、氯氧化銅、硫酸銅、氧化銅、快得寧(oxine-copper)及波爾多液混合物(Bordeaux mixture))、益發靈(dichlofluanid)、腈硫醯(dithianon)、多寧(dodine)、多寧游離鹼、福美鐵(ferbam)、氟福爾培(fluorofolpet)、福爾培(folpet)、雙胍辛鹽(guazatine)、乙酸雙胍辛鹽、雙胍辛胺(iminoctadine)、烷苯磺酸雙胍辛胺(iminoctadine albesilate)、三乙酸雙胍辛胺(iminoctadine triacetate)、代森錳銅(mancopper)、代森錳鋅(mancozeb)、代森錳(maneb)、代森聯(metiram)、代森聯鋅(metiram zinc)、丙森鋅(propineb)、硫及硫製劑(包括多硫化鈣、福美雙(thiram)、益洛寧(tolyfluanid)、代森鋅(zineb)、益穗(ziram))；

B14)選自由以下各物組成之清單的化合物：吡啶磺菌胺(amibromdole)、苯噻硫氰(benthiazole)、苯索辛

(bethoxazin)、卡巴西黴素(capsimycin)、香芹酮(carvone)、滅蟎猛(chinomethionat)、氯化苦(chloropicrin)、硫雜靈(cufraneb)、環氟菌胺(cyflufenamid)、霜脞氟(cymoxanil)、邁隆(dazomet)、咪菌威(debacarb)、噁菌清(diclomezine)、雙氯酚(dichlorophen)、氯硝胺(dicloran)、苯敵快(difenzoquat)、苯敵快甲基硫酸鹽、二苯基胺、乙噻博胺(ethaboxam)、噁菌脞(ferimzone)、氟美醯胺(flumetover)、磺菌胺(flusulfamide)、三乙磷酸鋁、三乙磷酸鈣、三乙磷酸鈉、氟吡菌胺(fluopicolide)、唑味草(fluoroimide)、六氯苯(hexachlorobenzene)、8-羥基喹啉硫酸鹽、伊魯米星(irumamycin)、磺菌威(methasulphocarb)、美曲芬諾(metrafenone)、異硫氰酸甲酯、滅粉黴素(mildiomyacin)、納他黴素(natamycin)、二甲基二硫胺基甲酸鎳、酞菌酯(nitrothal-isopropyl)、辛噻酮(octhilinone)、奧沙莫坎(oxamocarb)、氧氟辛(oxyfenthiin)、五氯苯酚及鹽、2-苯基苯酚及鹽、亞磷酸及其鹽、粉病靈(piperalin)、丙醇菌素鈉(propanosine-sodium)、普奎那茲(proquinazid)、吡咯尼寧(pyrralnitrine)、奎脫辛(quintozene)、葉枯酞(tecloftalam)、四氯硝基苯(tecnazene)、咪唑嗪(triazoxide)、水楊菌胺(trichlamide)、氟菌胺(zarilamid)及2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺醯基)-吡啶、N-(4-氯-2-硝基苯基)-N-乙基-4-甲基-苯磺醯胺、2-胺基-4-甲基-N-苯基-5-噁唑甲醯胺、2-氯-N-(2,3-二氫-1,1,3-三甲基-1H-節-4-基)-3-

吡啶甲醯胺、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基異噁唑啉-3-基]吡啶、順1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)-環庚醇、1-(2,3-二氫-2,2-二甲基-1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-甲酸甲酯、3,4,5-三氯-2,6-吡啶二腈、2-[[[環丙基[(4-甲氧基苯基)亞胺基]甲基]硫基]甲基]- α -(甲氧基亞甲基)-苯乙酸甲酯、4-氯- α -丙炔氧基-N-[2-[3-甲氧基-4-(2-丙炔氧基)苯基]乙基]-苯乙醯胺、(2S)-N-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔基]氧基]-3-甲氧基苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲基磺醯基)胺基]-丁醯胺、5-氯-7-(4-甲基哌啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶、5-氯-6-(2,4,6-三氟苯基)-N-[(1R)-1,2,2-三甲基丙基][1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、5-氯-N-[(1R)-1,2,2-二甲基丙基]-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、N-[1-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)乙基]-2,4-二氯菸鹼醯胺、N-(5-溴-3-氯吡啶-2-基)甲基-2,4-二氯菸鹼醯胺、2-丁氧基-6-碘-3-丙基-苯并哌喃-4-酮、N-[(Z)-[(環丙基甲氧基)亞胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]甲基]-2-苯基乙醯胺、N-(3-乙基-3,5,5-三甲基-環己基)-3-甲醯基胺基-2-羥基-苄醯胺、2-[[[[1-[3(1-氟-2-苯基乙基)氧基]苯基]亞乙基]胺基]氧基]甲基]- α -(甲氧基亞胺基)-N-甲基- α E-苯乙醯胺、N-{2-[3-氯-5-(三氟甲基)吡啶-2-基]乙基}-2-(三氟甲基)苄醯胺、N-(3',4'-二氯-5-氟聯苯-2-基)-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、2-(2-{[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟嘧啶-4-基]氧基}苯基)-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基乙醯胺、1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基-1H-咪唑-

1-甲酸、O-[1-[(4-甲氧基苯氧基)甲基]-2,2-二甲基丙基]-1H-咪唑-1-硫代羧酸。

包含式(I)化合物與殺菌劑化合物之混合物的本發明組合物亦可特別有利。合適的殺菌劑混合搭配物之實例可選自以下清單：溴硝醇(bronopol)、雙氯酚(dichlorophen)、三氯甲基吡啶(nitrapyrin)、二甲基二硫胺基甲酸鎳、春日黴素、辛噻酮、呋喃甲酸、土黴素(oxytetracycline)、噻菌靈、鏈黴素、葉枯酞、硫酸銅及其他銅製劑。

根據本發明之式(I)化合物及殺真菌劑組合物可用以治療性或預防性地控制植物或作物之植物病原性真菌。

因此，根據本發明之另一態樣，提供一種治療性或預防性地控制植物或作物之植物病原性真菌的方法，其特徵在於將根據本發明之式(I)化合物或殺真菌劑組合物施用於種子，植物或施用於植物之果實或施用於植物生長或需要其生長之土壤。

本發明之處理方法亦可適用於處理繁殖材料，諸如塊莖或根莖，以及種子、幼苗或移植幼苗及植物或移植植物。該處理方法亦可適用於處理根。本發明之處理方法亦可適用於處理植物之地上部分，諸如所關注植物之幹、莖或梗、葉、花及果實。

在可藉由本發明方法保護之植物中，可提及棉花、亞麻、葡萄樹、水果或蔬菜作物，諸如薔薇科(*Rosaceae* sp.)(例如仁果類水果，諸如蘋果及梨，以及核果，諸如杏、杏仁及桃)、茶藨子科(*Ribesioideae* sp.)、胡桃科

(*Juglandaceae sp.*)、樺木科(*Betulaceae sp.*)、漆樹科(*Anacardiaceae sp.*)、山毛櫸科(*Fagaceae sp.*)、桑科(*Moraceae sp.*)、木犀科(*Oleaceae sp.*)、獼猴桃科(*Actinidaceae sp.*)、樟科(*Lauraceae sp.*)、芭蕉科(*Musaceae sp.*)(例如香蕉樹及車前草(*plantin*))、茜草科(*Rubiaceae sp.*)、茶科(*Theaceae sp.*)、梧桐科(*Sterculiaceae sp.*)、芸香科(*Rutaceae sp.*)(例如檸檬、橙子及葡萄柚)；茄科(*Solanaceae sp.*)(例如番茄)、百合科(*Liliaceae sp.*)、菊科(*Asteraceae sp.*)(例如萵苣)、傘形科(*Umbelliferae sp.*)、十字花科(*Cruciferae sp.*)、藜科(*Chenopodiaceae sp.*)、葫蘆科(*Cucurbitaceae sp.*)、蝶形花科(*papilionaceae sp.*)(例如豌豆)、薔薇科(*Rosaceae sp.*)(例如草莓)；主要作物，諸如禾本科(*Graminae sp.*)(例如玉米、草坪或穀物，諸如小麥、水稻、大麥及黑小麥)、菊科(*Asteraceae sp.*)(例如向日葵)、十字花科(*Cruciferae sp.*)(例如芸苔)、豆科(*Fabacae sp.*)(例如花生)、蝶形花科(*Papilionaceae sp.*)(例如大豆)、茄科(*Solanaceae sp.*)(例如馬鈴薯)、藜科(*Chenopodiaceae sp.*)(例如甜菜根)；園藝及森林作物；以及該等作物之遺傳修飾同系物。

在可藉由本發明之方法控制之植物或作物疾病中，可提及：

- 白粉病，諸如：

例如由禾本科布氏白粉菌(*Blumeria graminis*)引起之小麥白粉病(*Blumeria disease*)；

例如由白叉絲單囊殼菌 (*Podosphaera leucotricha*) 引起之蘋果白粉病 (*Podosphaera disease*) ;

例如由黃瓜白粉病菌 (*Sphaerotheca fuliginea*) 引起之黃瓜白粉病 (*Sphaerotheca disease*) ;

例如由葡萄白粉病菌 (*Uncinula necator*) 引起之葡萄白粉病 (*Uncinula disease*) ;

- 銹病，諸如：

例如由梨銹病菌 (*Gymnosporangium sabinae*) 引起之梨銹病 (*Gymnosporangium disease*) ;

例如由咖啡駝孢鏽菌 (*Hemileia vastatrix*) 引起之咖啡銹病 (*Hemileia disease*) ;

例如由豆薯層鏽菌 (*Phakopsora pachyrhizi*) 或邁博姆層鏽菌 (*Phakopsora meibomia*) 引起之層鏽菌病 (*Phakopsora disease*) ;

例如由隱匿柄鏽菌 (*Puccinia recondita*) 引起之小麥柄鏽菌病 (*Puccinia disease*) ;

例如由菜豆銹病菌 (*Uromyces appendiculatus*) 引起之菜豆銹病 (*Uromyces disease*) ;

- 卵菌病 (Oomycete disease)，諸如：

例如由萵苣霜黴菌 (*Bremia lactucae*) 引起之萵苣霜黴病 (*Bremia disease*) ;

例如由豌豆霜黴菌 (*Peronospora pisi*) 或甘藍根腫菌 (*P. brassicae*) 引起之霜黴菌病 (*Peronospora disease*) ;

例如由晚疫病菌 (*Phytophthora infestans*) 引起之疫黴

病 (Phytophthora disease) ;

例如由葡萄生單軸黴病 (*Plasmopara viticola*) 引起之單軸黴病 (Plasmopara disease) ;

例如由蛇麻草霜黴病菌 (*Pseudoperonospora humuli*) 或黃瓜霜黴病菌 (*Pseudoperonospora cubensis*) 引起之假霜黴病 (Pseudoperonospora disease) ;

例如由終極腐黴菌 (*Pythium ultimum*) 引起之腐黴菌病 (Pythium disease) ;

褐斑病 (Leafspot)、葉斑病 (leaf blotch) 及葉枯病 (leaf blight disease) , 諸如 :

例如由番茄早疫病菌 (*Alternaria solani*) 引起之交鏈孢屬病 (Alternaria disease) ;

例如由甜菜褐斑病菌 (*Cercospora beticola*) 引起之尾孢屬病 (Cercospora disease) ;

例如由黃瓜黑星病菌 (*Cladosporium cucumerinum*) 引起之枝孢屬病 (Cladosporium disease) ;

例如由禾旋孢腔菌病 (*Cochliobolus sativus*) 引起之旋孢腔菌屬病 (Cochliobolus disease) ;

例如由菜豆炭疽病菌 (*Colletotrichum lindemuthanium*) 引起之刺盤孢病 (Colletotrichum disease) ;

例如由油橄欖孔雀斑病菌 (*Cycloconium oleaginum*) 引起之孔雀斑病 (Cycloconium disease) ;

例如由柑桔間座殼 (*Diaporthe citri*) 引起之腐皮殼屬病 (Diaporthe disease) ;

例如由柑桔痂囊腔菌 (*Elsinoe fawcettii*) 引起之痂囊腔菌屬病 (*Elsinoe disease*) ;

例如由桃炭疽病菌 (*Gloeosporium laeticolor*) 引起之炭疽病 (*Gloeosporium disease*) ;

例如由蘋果炭疽病菌 (*Glomerella cingulata*) 引起之炭疽病 (*Glomerella disease*) ;

例如由葡萄球座菌 (*Guignardia bidwelli*) 引起之球座菌屬病 (*Guignardia disease*) ;

例如由油菜黑脛病菌 (*Leptosphaeria maculans*)、穎枯殼小球腔菌 (*Leptosphaeria nodorum*) 引起之小球腔菌屬病 (*Leptosphaeria disease*) ;

例如由稻瘟病菌 (*Magnaporthe grisea*) 引起之稻瘟病 (*Magnaporthe disease*) ;

例如由禾生球腔菌 (*Mycosphaerella graminicola*)、花生球腔菌 (*Mycosphaerella arachidicola*)、香蕉黑條葉斑病菌 (*Mycosphaerella fijiensis*) 引起之球腔菌病 (*Mycosphaerella disease*) ;

例如由穎枯殼針孢 (*Phaeosphaeria nodorum*) 引起之穎枯病 (*Phaeosphaeria disease*) ;

例如由圓核腔菌 (*Pyrenophora teres*) 引起之核腔菌屬病 (*Pyrenophora disease*) ;

例如由柱隔孢 (*Ramularia collo-cygni*) 引起之柱隔孢屬病 (*Ramularia disease*) ;

例如由禾草雲斑病菌 (*Rhynchosporium secalis*) 引起之

喙孢屬病 (*Rhynchosporium disease*) ;

例如由芹菜斑枯病菌 (*Septoria apii*) 或番茄白星病菌 (*Septoria lycopersici*) 引起之殼針孢屬病 (*Septoria disease*) ;

例如由灰色雪黴菌 (*Typhula incarnata*) 引起之灰色雪黴病 (*Typhula disease*) ;

例如由蘋果黑星病菌 (*Venturia inaequalis*) 引起之黑星菌病 (*Venturia disease*) ;

- 根及莖病，諸如：

例如由禾穀伏革菌 (*Corticium graminearum*) 引起之伏革菌病 (*Corticium disease*) ;

例如由尖孢镰孢菌 (*Fusarium oxysporum*) 引起之镰孢菌屬病 (*Fusarium disease*) ;

例如由禾頂囊殼菌 (*Gaeumannomyces graminis*) 引起之頂囊殼屬病 (*Gaeumannomyces disease*) ;

例如由立枯絲核菌 (*Rhizoctonia solani*) 引起之絲核菌病 (*Rhizoctonia disease*) ;

例如由針形輪紋病菌 (*Tapesia acuformis*) 引起之輪紋病 (*Tapesia disease*) ;

例如由根串珠黴菌 (*Thielaviopsis basicola*) 引起之根串珠黴屬病 (*Thielaviopsis disease*) ;

- 穗及圓錐花序病，諸如：

例如由交鏈孢屬 (*Alternaria spp.*) 引起之交鏈孢屬病 (*Alternaria disease*) ;

例如由黃麴黴 (*Aspergillus flavus*) 引起之麴黴屬病 (*Aspergillus disease*) ;

例如由枝孢屬 (*Cladosporium spp.*) 引起之枝孢屬病 (*Cladosporium disease*) ;

例如由麥角病菌 (*Claviceps purpurea*) 引起之麥角菌屬病 (*Claviceps disease*) ;

例如由黃色镰孢菌 (*Fusarium culmorum*) 引起之镰孢菌屬病 (*Fusarium disease*) ;

例如由玉蜀黍赤黴 (*Gibberella zeae*) 引起之赤黴菌病 (*Gibberella disease*) ;

例如由雪腐明梭孢屬 (*Monographella nivalis*) 引起之雪黴葉枯病 (*Monographella disease*) ;

● 黑穗病 (Smut and bunt disease) , 諸如 :

例如由高粱絲黑穗病菌 (*Sphacelotheca reiliana*) 引起之軸黑粉菌屬病 (*Sphacelotheca disease*) ;

例如由小麥腥黑穗病菌 (*Tilletia caries*) 引起之腥黑粉菌病 (*Tilletia disease*) ;

例如由黑麥桿黑穗病菌 (*Urocystis occulta*) 引起之條黑粉菌屬病 (*Urocystis disease*) ;

例如由麥散黑粉菌 (*Ustilago nuda*) 引起之黑粉菌屬病 (*Ustilago disease*) ;

● 爛果及黴果病 (Fruit rot and mould disease) , 諸如 :

例如由黃麴黴 (*Aspergillus flavus*) 引起之麴黴屬病 (*Aspergillus disease*) ;

例如由灰葡萄孢菌 (*Botrytis cinerea*) 引起之葡萄孢屬病 (*Botrytis disease*) ;

例如由擴展青黴 (*Penicillium expansum*) 引起之青黴屬病 (*Penicillium disease*) ;

例如由核盤菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 引起之核盤菌屬病 (*Sclerotinia disease*) ;

例如由黃萎輪枝黴 (*Verticilium alboatrum*) 引起之輪枝孢菌病 (*Verticilium disease*) ;

- 種子及土傳腐敗、黴菌、枯萎、腐爛及立枯病，諸如：

例如由黃色鐮孢菌引起之鐮孢菌屬病；

例如由惡疫黴 (*Phytophthora cactorum*) 引起之疫黴病 (*Phytophthora disease*) ;

例如由終極腐黴菌引起之腐黴菌病；

例如由立枯絲核菌引起之絲核菌病；

例如由齊整小核菌 (*Sclerotium rolfsii*) 引起之菌核病 (*Sclerotium disease*) ;

例如由雪黴鐮孢菌 (*Microdochium nivale*) 引起之微結節菌屬病 (*Microdochium disease*) ;

- 腐爛病、頂蓬裂病及頂枯病，諸如：

例如由仁果幹癌叢赤殼菌 (*Nectria galligena*) 引起之叢赤殼屬病 (*Nectria disease*) ;

- 枯萎病，諸如：

例如由子囊菌亞門鏈核盤菌屬 (*Monilinia laxa*) 引起之

鏈核盤菌屬病 (*Monilinia disease*) ;

葉炮病或縮葉病，諸如：

例如由桃縮葉畸形外囊菌 (*Taphrina deformans*) 引起之外囊菌屬病 (*Taphrina disease*) ;

- 木本植物之消耗病，諸如：

例如由葡萄樹早衰病菌 (*Phaemoniella clamydospora*) 引起之艾斯卡病 (*Esca disease*) ;

例如由葡萄頂枯病菌 (*Eutypa lata*) 引起之葡萄頂枯病 (*Eutypa dyeback*) ;

例如由榆枯萎病菌 (*Ceratocystis ulmi*) 引起之荷蘭榆樹病 (*Dutch elm disease*) ;

- 花及種子病，諸如：

例如由灰葡萄孢菌引起之葡萄孢屬病；

- 塊莖病，諸如：

例如由立枯絲核菌引起之絲核菌病。

本發明之殺真菌劑組合物亦可用以對抗易於生長於木材上或內部之真菌疾病。術語"木材"意謂所有類型之木材種類，及意欲用於建築之所有類型經加工之此木材，例如實木、高密度木材、層壓板及膠合板。根據本發明用於處理木材之方法主要由接觸一或多種本發明之化合物或本發明之組合物組成，其包括(例如)直接塗覆、噴霧、浸漬、注射或任何其他合適方式。

常用於本發明處理方法中之活性化合物的劑量對於葉片處理之應用而言一般且有利地為10至800公克/公頃，較佳

為50至300公克/公頃。所施用之活性物質的劑量在種子處理之情況下一般且有利地為每100公斤種子2至200公克，較佳為每100公斤種子3至150公克。

應清楚地瞭解，本文中所指示之劑量係以根據本發明之方法的說明性實例給出。熟習此項技術者應瞭解如何特別根據待處理植物或作物之性質來調適施用劑量。

本發明之殺真菌劑組合物亦可用於以本發明之化合物或本發明之農用化學組合物來處理經遺傳修飾之生物體。經遺傳修飾之植物為於其基因組中穩定併入編碼所關注蛋白之異源基因的植物。表述"編碼所關注蛋白之異源基因"基本上意謂給予經轉型植物以新農藝學特性的基因，或用於改良經修飾植物之農藝學品質的基因。

本發明之化合物或混合物亦可用於製備適用以治療性或預防性地治療人類或動物真菌疾病的組合物，該等人類或動物真菌疾病諸如黴菌病、皮膚病、毛癬菌屬病及念珠菌病(candidiases)或由麴黴屬(例如菸麴黴(*Aspergillus fumigatus*))引起之疾病。

【實施方式】

現將參考以下化合物實例表A及以下製備或功效實例來說明本發明之各態樣。

下表以非限制性方式說明本發明化合物之實例。

在下表中，M+H(或M-H)分別意謂如在質譜中所觀測之分子離子峰加或減1 a.m.u.(原子質量單位)且M(ApCI+)意謂如在質譜中經由正性大氣壓化學電離所見之分子離子峰。

在下表中，logP值係使用下述方法，根據EEC Directive 79/831 Annex V.A8藉由逆相管柱(C 18)HPLC(高效液相層析)來測定：

溫度：40℃；移動相：0.1%甲酸水溶液及乙腈；10%乙腈至90%乙腈之線性梯度。

使用具有已知logP值(使用兩個連續烷酮之間的線性內插，藉由滯留時間測定logP值)之非支鏈烷-2-酮(包含3至16個碳原子)來進行校準。

使用190 nm至400 nm之UV光譜，於層析信號之最大值中測定 λ 最大值。

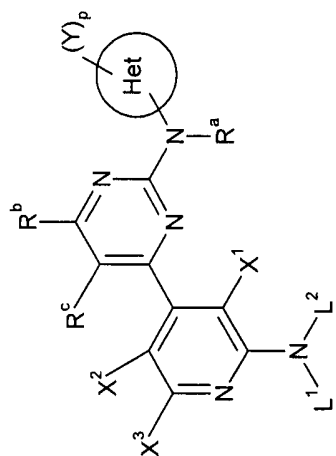
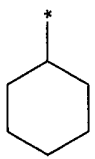
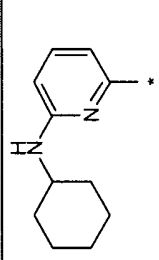

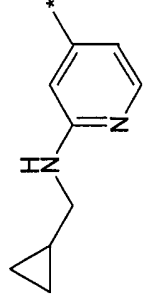

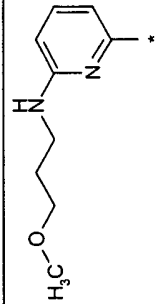
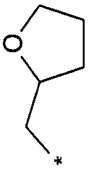
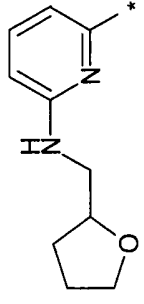
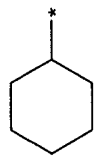
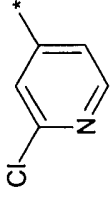
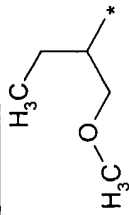
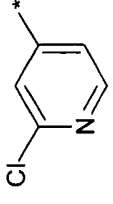
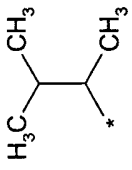
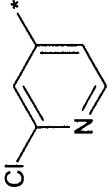
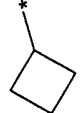
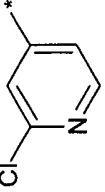
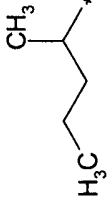
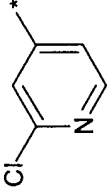
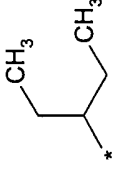
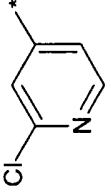
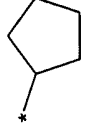
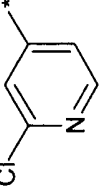
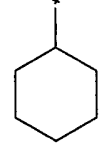
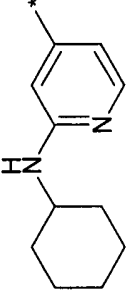

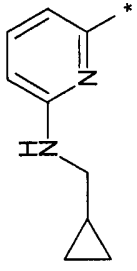

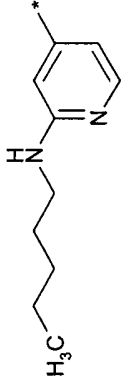
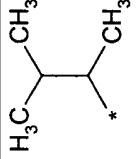
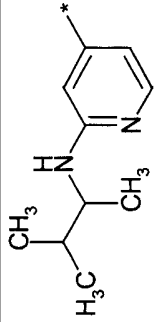

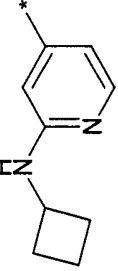

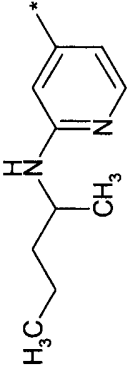
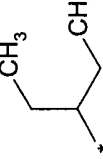
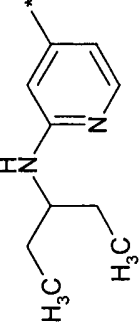
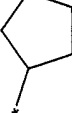
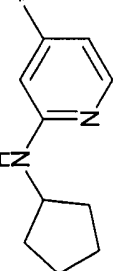


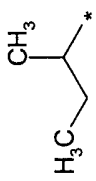
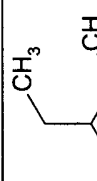
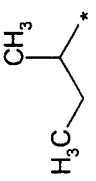
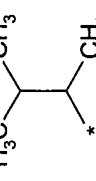
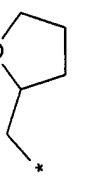
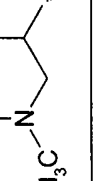
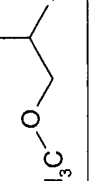
表 A

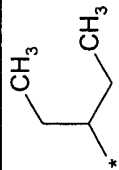
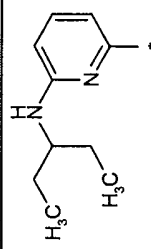

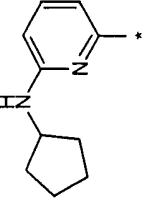
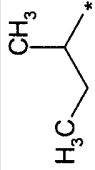
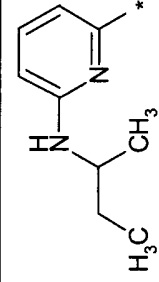
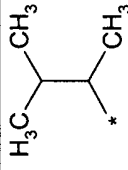
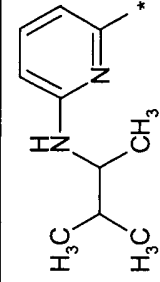
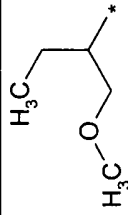
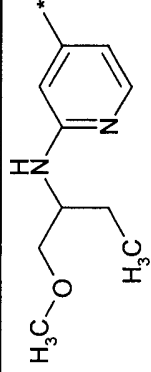
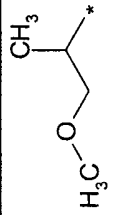
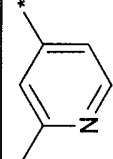
實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het)(Y) ^p	X ¹	X ²	X ³	所量測之 Mw	log P HCOOH
1	H	H ₃ C—*	甲基	H	H		H	H	H		1.24
2	H		H	H	H		H	H	H		1.35
3	H		H	H	H		H	H	H	194,5	1.12



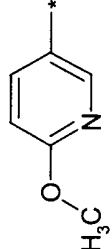
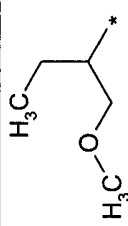
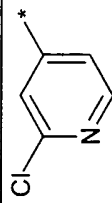
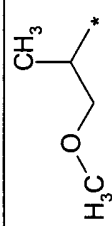
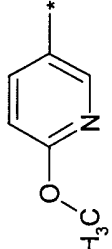
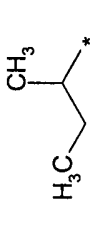
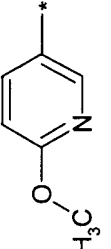
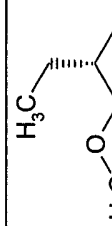
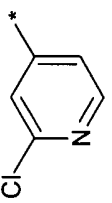
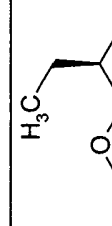
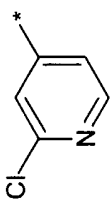
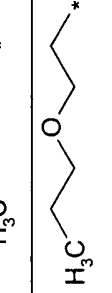
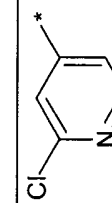
實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p	X ¹	X ²	X ³	所量測之 Mw	log p HCOOH
4	H		H	H	H		H	H	H	444	1.70
5	H		H	H	H		H	H	H	388	0.97
6	H		H	H	H		H	H	H	424	0.83
7	H		H	H	H		H	H	H	225	0.86
8	H		H	H	H		H	H	H	381	1.64
9	H		H	H	H		H	H	H	385	1.37



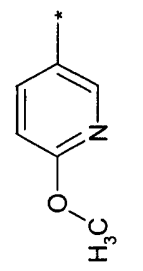
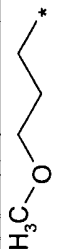
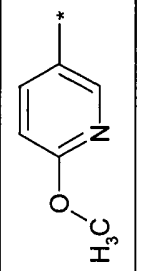
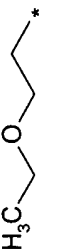
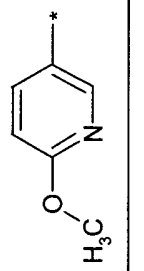

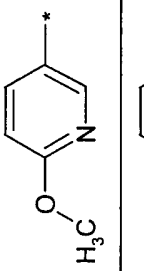

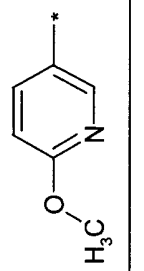
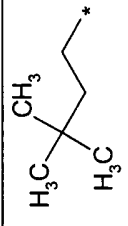
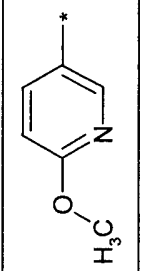

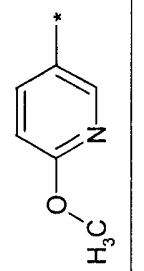
實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p	X ¹	X ²	X ³	所量測之 MW	log P HCOOH
10	H		H	H	H		H	H	H	369	1.66
11	H		H	H	H		H	H	H	353	1.45
12	H		H	H	H		H	H	H	369	1.72
13	H		H	H	H		H	H	H	369	1.64
14	H		H	H	H		H	H	H	367	1.58
15	H		H	H	H		H	H	H	444	1.52
16	H		H	H	H		H	H	H	388	0.96


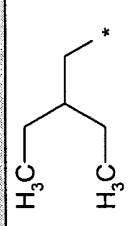
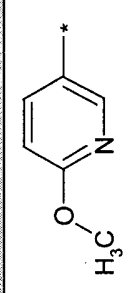
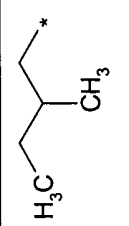
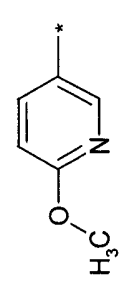
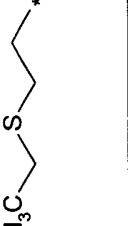
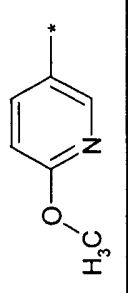
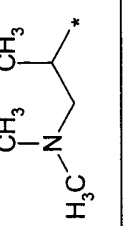
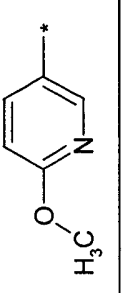
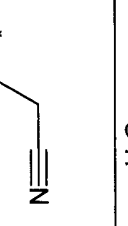
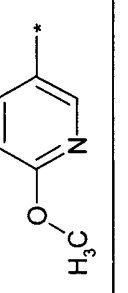
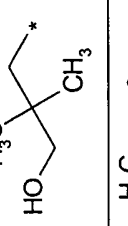
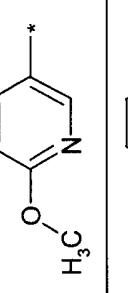
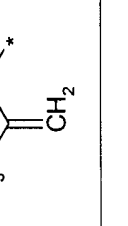
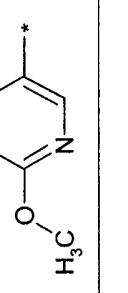
實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p (Y) ^q	X ¹	X ²	X ³	所量測之 Mw	log p HCOOH
17	H		H	H	H		H	H	H	418	1.57
18	H		H	H	H		H	H	H	420	1.34
19	H		H	H	H		H	H	H	388	1.05
20	H		H	H	H		H	H	H	420	1.43
21	H		H	H	H		H	H	H	420	1.33
22	H		H	H	H		H	H	H	416	1.22


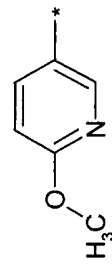
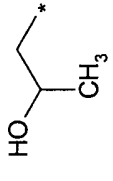
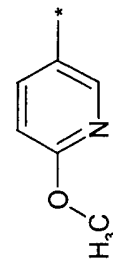
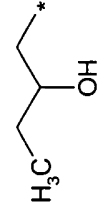
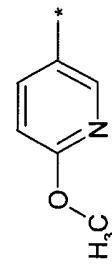
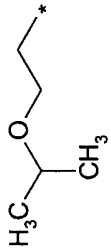
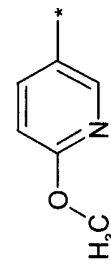

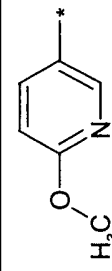
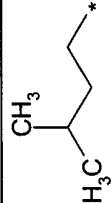
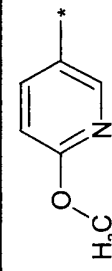

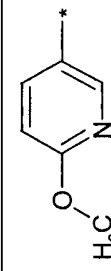
實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	X ¹	X ²	X ³	所量測之 MW	log P HCOOH
23	H		H	H	H	H	H	H	392	1.10
24	H		H	H	H	H	H	H	369	2.09
25	H		H	H	H	H	H	H	355	2.00
26	H		H	H	H	H	H	H	369	2.15
27	H		H	H	H	H	H	H	383	1.64
28	H		H	H	H	H	H	H	384	1.42
29	H		H	H	H	H	H	H	385	1.85


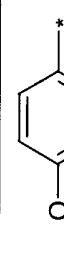
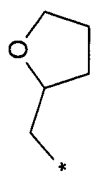
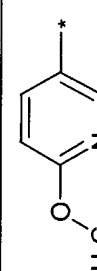

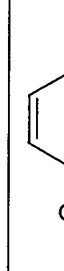
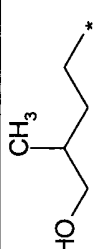
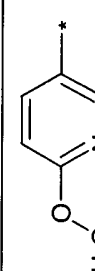

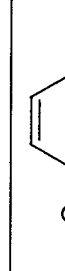

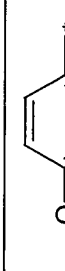

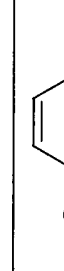
實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p	X ¹	X ²	X ³	所量測之 Mw	log p HCOOH
30	H		H	H	H		H	H	H	420	1.47
31	H		H	H	H		H	H	H	208,5	1.23
32	H		H	H	H		H	H	H	196,5	1.23
33	H		H	H	H		H	H	H	420	1.43
34	H		H	H	H		H	H	H	452	1.10
35	H		H	H	H		H	H	H	371	1.34


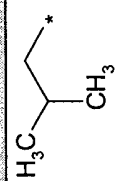
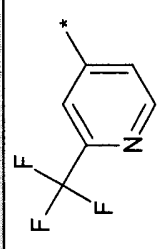
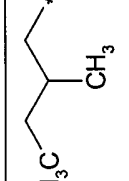
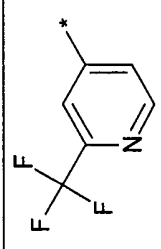
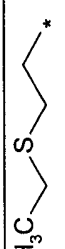
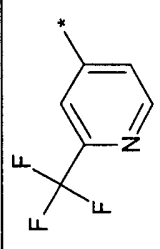
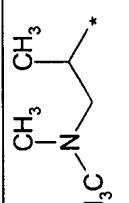
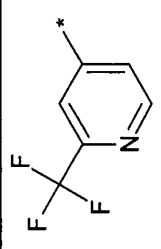

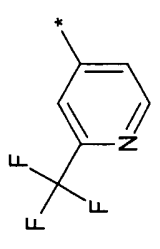
實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c		X ¹	X ²	X ³	所量測之 MW	log p HCOOH
36	H		H	H	H		H	H	H	351,2	1.10
37*	H		H	H	H		H	H	H	385	1.49
38	H		H	H	H		H	H	H	367,2	1.29
39	H		H	H	H		H	H	H	351	1.48
40	H		H	H	H		H	H	H		
41	H		H	H	H		H	H	H		
42	H		H	H	H		H	H	H	385	

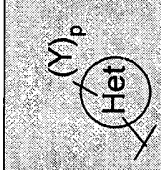
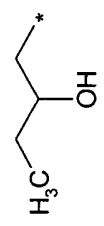
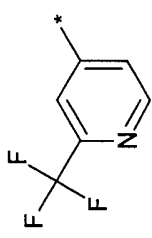
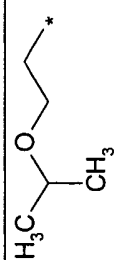
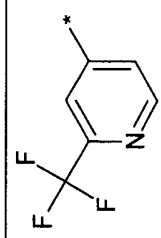
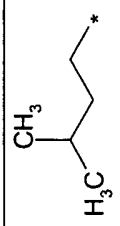
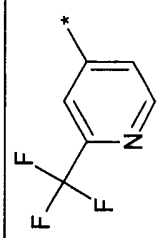
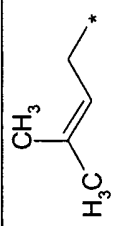
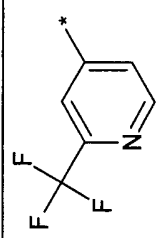
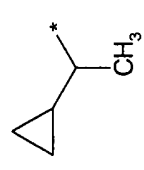
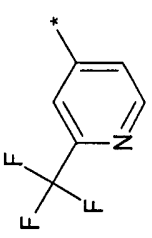
實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c		X ¹	X ²	X ³	所量測之 Mw	log P HCOOH
49	H		H	H	H		H	H	H	420	
50	H		H	H	H		H	H	H	367	
51	H		H	H	H		H	H	H	367	
52	H		H	H	H		H	H	H	349	
53	H		H	H	H		H	H	H	353	
54	H		H	H	H		H	H	H	379	
55	H		H	H	H		H	H	H	333	

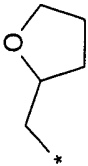
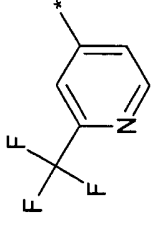

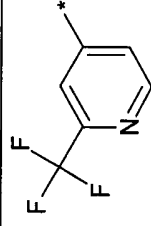

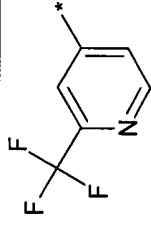

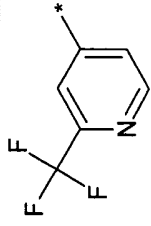

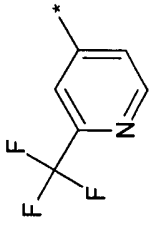
實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c		X ¹	X ²	X ³	分子量	log P HCOOH
56	H		H	H	H		H	H	H	379	
57	H		H	H	H		H	H	H	365	
58	H		H	H	H		H	H	H	383	
59	H		H	H	H		H	H	H	380	
60	H		H	H	H		H	H	H	348	
61	H		H	H	H		H	H	H	381	
62	H		H	H	H		H	H	H	349	

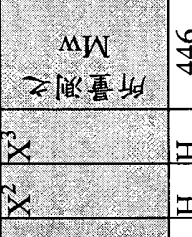


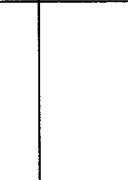
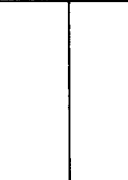





實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p	X ¹	X ²	X ³	分子量	log P HCOOH
63	H		H	H	H		H	H	H	383	
64	H		H	H	H		H	H	H	353	
65	H		H	H	H		H	H	H	367	
66	H		H	H	H		H	H	H	381	
67	H		H	H	H		H	H	H	379	
68	H		H	H	H		H	H	H	365	
69	H		H	H	H		H	H	H	351	

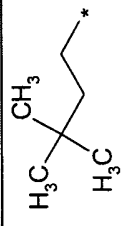
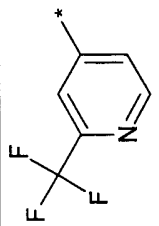
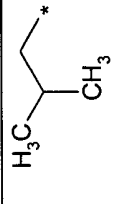
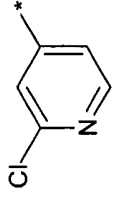
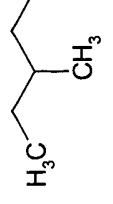
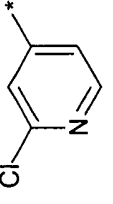

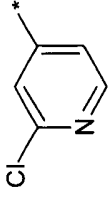
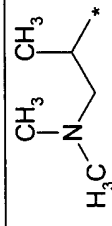
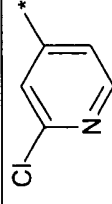

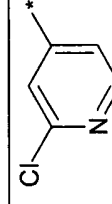
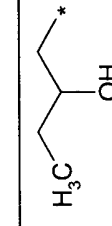
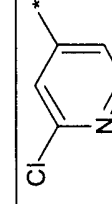
實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p (Y) ^q	X ¹	X ²	X ³	所量測之 MW	log p HCOOH
70	H		H	H	H		H	H	H	369	
71	H		H	H	H		H	H	H	379	
72	H		H	H	H		H	H	H	367	
73	H		H	H	H		H	H	H	381	
74	H		H	H	H		H	H	H	381	
75	H		H	H	H		H	H	H	381	
76	H		H	H	H		H	H	H	349	

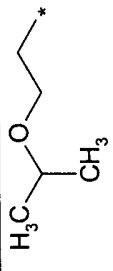
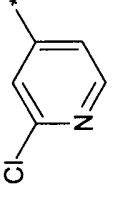

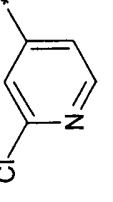
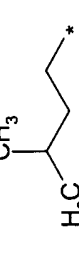
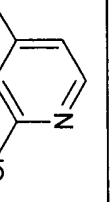
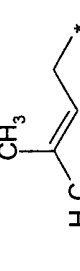
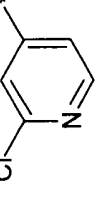
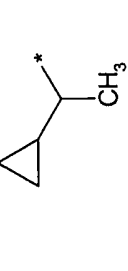
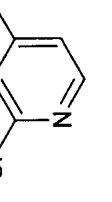
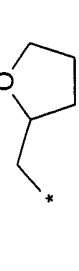
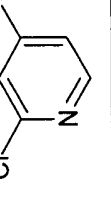
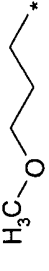
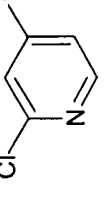
實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c		X ¹	X ²	X ³	所量測之 Mw	log P HCOOH
77	H		H	H	H		H	H	H	389	
78	H		H	H	H		H	H	H	403	
79	H		H	H	H		H	H	H	421	
80	H		H	H	H		H	H	H	418	
81	H		H	H	H		H	H	H	421	

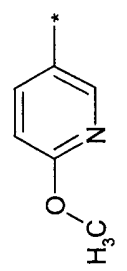
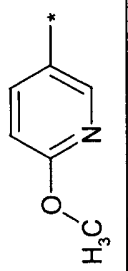
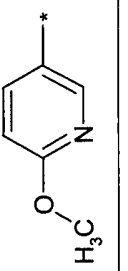
實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c		X ¹	X ²	X ³	所量測之 MW	log p HCOOH
82	H		H	H	H		H	H	H	405	
83	H		H	H	H		H	H	H	419	
84	H		H	H	H		H	H	H	403	
85	H		H	H	H		H	H	H	401	
86	H		H	H	H		H	H	H	401	

實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p (Y)	X ¹	X ²	X ³	所量測之 Mw	log p HCOOH
87	H		H	H	H		H	H	H	417	
88	H		H	H	H		H	H	H	405	
89	H		H	H	H		H	H	H	419	
90	H		H	H	H		H	H	H	417	
91	H		H	H	H		H	H	H	387	

實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c		X ¹	X ²	X ³	所量測之 MW	log p HCOOH
92	H		H	H	H		H	H	H	446	
93	H		H	H	H		H	H	H	472	
94	H		H	H	H		H	H	H	405	
95	H		H	H	H		H	H	H	405	
96	H		H	H	H		H	H	H	391	

實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p	X ¹	X ²	X ³	所量測之 Mw	log P HCOOH
97	H		H	H	H		H	H	H	417	
98	H		H	H	H		H	H	H	355	2.17
99	H		H	H	H		H	H	H	369	2.17
100	H		H	H	H		H	H	H	387	2.17
101	H		H	H	H		H	H	H	384	2.17
102	H		H	H	H		H	H	H	387	
103	H		H	H	H		H	H	H	371	

實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(Het) ^p	X ¹	X ²	X ³	所量測之 Mw	log P HCOOH
104	H		H	H	H		H	H	H	385	
105	H		H	H	H		H	H	H	383	
106	H		H	H	H		H	H	H	369	
107	H		H	H	H		H	H	H	367	
108	H		H	H	H		H	H	H	367	
109	H		H	H	H		H	H	H	383	
110	H		H	H	H		H	H	H	371	

實例號	R ^a	L ¹	L ²	R ^b	R ^c	(M) _p Het	X ¹	X ²	X ³	所量測之 MW	log p HCOOH
118	H	-C(CH ₃)=N-C(CH ₃)=N-		H	H		H	H	H		2.11
119	H	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		H	H		H	H	H	349,3	1.42
120	H	-COCH ₂ CH ₂ CH ₂ -		H	H		H	H	H	363	2.17

以下實例以非限制性方式說明本發明之式(I)化合物的製備及功效。

根據方法 P1 製備 N-(2-氯吡啶-4-基)-4-(2-{[1-(甲氧基甲基)丙基]胺基}吡啶-4-基)嘧啶-2-胺(化合物 9)

將 300 mg N,4-雙(2-氯吡啶-4-基)嘧啶-2-胺(0.94 mmol)、486 mg 1-甲氧基丁-2-胺(4.71 mmol)於 0.6 ml 1-甲基-2-吡咯啉酮中在微波輻射下在 240°C 下加熱 90 分鐘。冷卻後，將反應混合物傾入 10 ml 二氯甲烷中，以 5 ml 水洗滌兩次。經硫酸鎂乾燥，過濾且於真空中濃縮後，將粗產物於二氧化矽(乙酸乙酯/庚烷)上層析，以得到 0.72 g N-(2-氯吡啶-4-基)-4-(2-{[1-(甲氧基甲基)丙基]胺基}吡啶-4-基)嘧啶-2-胺(產率=19%)。

[M+1]=385

製備 N,4-雙(2-氯吡啶-4-基)嘧啶-2-胺(式(II)化合物)

製備{(Z)-[(2-氯吡啶-4-基)胺基]次甲基}雙胺基甲酸二第三丁酯：

在 0-5°C 下，將 20.22 g(0.157 mol)4-胺基-2-氯吡啶稀釋於三乙胺(67 ml)及二氯甲烷(600 ml)中。將 47 g 氯化汞(II)(0.173 mol)及 50.24 g(0.173 mol)N,N'-雙(boc)-S-甲基-異硫脲添加至反應混合物中，接著將其於室溫下攪拌四天，於燒結漏斗上過濾，於真空中濃縮且在二氧化矽(庚烷 90/AcOEt 10)上層析，以得到 43.67 g {(Z)-[(2-氯吡啶-4-基)胺基]次甲基}雙胺基甲酸二第三丁酯(產率=71%)。

[M+1]=371

製備 1-(2-氯吡啶-4-基)胍雙(三氟乙酸酯)：

將 81.64 ml 三氟乙酸 (1.06 mol) 添加至室溫下於二氯甲烷 (800 ml) 中之 43.67 g (0.117 mol) {(Z)-[(2-氯吡啶-4-基)胺基]次甲基}雙胺基甲酸二第三丁酯之溶液。將反應混合物在室溫下攪拌 2 天，於真空中濃縮，以 100 ml 戊烷濕磨且經靜置結晶，以得到 51.68 g 1-(2-氯吡啶-4-基)胍雙(三氟乙酸酯)(產率=99%)。

$$[M+1-2*CF_3CO_2H]=171$$

製備 N,4-雙(2-氯吡啶-4-基)嘧啶-2-胺：

將 2.52 g 氫氧化鈉 (63 mmol) 及 11.96 g 1-(2-氯吡啶-4-基)胍雙(三氟乙酸酯) (30 mmol) 添加至於 60 ml 2-丙醇中之 6.32 g 1-(2-氯吡啶-4-基)-3-(二甲基胺基)丙-2-烯-1-酮 (30 mmol) 之溶液中。將反應混合物在攪拌下加熱至回流持續 20 h。過濾後，將沈澱物以 100 ml 正丁醇及 120 ml *i*Pr₂O 洗滌且接著風乾，以得到 4.69 g N,4-雙(2-氯吡啶-4-基)嘧啶-2-胺(產率=37%)。

$$[M+1]=318$$

生物實例

實例 A：對寄生霜黴菌 (*Peronospora parasitica*) (十字花科霜黴菌 (*Crucifer downy mildew*)) 之活體內測試

藉由在丙酮/吐溫/DMSO 之混合物中均質化來製備所測試之活性成份，接著將其以水稀釋以獲得所需活性物質濃度。

在子葉期藉由以上述水性懸浮液噴霧來處理播種在

50/50泥炭土-火山灰基質上且在18-20°C下生長之起始杯中的甘藍菜植物(Eminence變種)。

以不含有活性物質之水溶液處理用作對照之植物。

24小時後，藉由以寄生霜黴菌孢子之水懸浮液(每毫升50000個孢子)對植物噴霧使其受污染。自經感染之植物收集孢子。

在潮濕氣氛下，將經污染之甘藍菜植物在20°C下培育5天。

在污染後5天，與對照植物相比進行分級。

在該等條件下，使用以下化合物：9、11、13、15、18、19、20、21、22、23、28、37、49、53、64、65、92、109、110、113及115，在500 ppm之劑量下觀測到良好保護(至少70%)或完全保護。

實例B：對灰葡萄孢菌(灰黴菌)之活體內測試

藉由在丙酮/吐溫/DMSO之混合物中均質化來製備所測試之活性成份，接著將其以水稀釋獲得所需活性物質。

在子葉Z11期，藉由以如上所述製備之活性成份噴霧來處理在起始杯中播種在50/50泥炭土-火山灰基質上且在18-20°C下生長之小黃瓜植物(Vert petit de Paris變種)。

以不含有活性物質之水溶液處理用作對照之植物。

24小時後，藉由使灰葡萄孢菌(*Botrytis cinerea*)孢子之水懸浮液(每毫升150,000個孢子)滴沈積於葉片之上表面上而使植物受污染。自15天之培養物收集孢子且將其懸浮於由以下各物組成之營養液中：

- 20 g/L明膠；
- 50 g/L D-果糖；
- 2 g/L NH_4NO_3 ；
- 1 g/L KH_2PO_4 。

將受污染之黃瓜植物置於15-11°C(日/夜)及80%相對濕度之氣候室中歷時5-7天。

在污染後5/7天，與對照植物相比進行分級。

在該等條件下，使用以下化合物：9、11、12、13、21、37、39、42、43、44、50、51、52、69、74、76及106，在500 ppm之劑量下觀測到良好保護(至少70%)及完全保護。

實例C：對白菜黑斑病菌(*Alternaria brassicae*)(十字花科植物褐斑病菌)之活體內測試

藉由在丙酮/吐溫/DMSO之混合物中均質化來製備所測試之活性成份，接著將其以水稀釋以獲得所需活性物質。

在子葉期，藉由以如上所述製備之活性成份噴霧來處理在起始杯中播種在50/50泥炭土-火山灰基質上且在18-20°C下生長之蘿蔔植物(Pernot變種)。

以不含有活性物質之丙酮/吐溫/水之混合物處理用作對照之植物。

24小時後，藉由以白菜黑斑病菌孢子之水性懸浮液(每立方公分40,000個孢子)對植物噴霧使其受污染。自12至13天培養物收集孢子。

將受污染之蘿蔔植物在潮濕氣氛下，在約18°C下培育6-

7天。

在污染後6至7天，與對照植物相比進行分級。

在該等條件下，使用以下化合物：9、11、13、37、43、57、110及115，在500 ppm之劑量下觀測到良好保護(至少70%)。

實例D：對黃瓜白粉病菌(瓜類白粉病菌)之活體內測試

藉由在丙酮/吐溫/DMSO之混合物中均質化來製備所測試之活性成份，接著將其以水稀釋獲得所需活性物質。

在子葉Z10期，藉由以上述水性懸浮液噴霧來處理播種在50/50泥炭土-火山灰基質上且在20°C/23°C下生長之起始杯中的小黃瓜植物(Vert petit de Paris變種)。以不含有活性物質之水溶液處理用作對照之植物。

24小時後，藉由以黃瓜白粉病菌孢子之水性懸浮液(每毫升100 000個孢子)對植物噴霧使其受污染。自受污染之植物收集孢子。將受污染之小黃瓜植物在約20°C/25°C及60/70%相對濕度下培育。

在污染後12天，與對照植物相比進行分級(功效%)。

在該等條件下，使用以下化合物：9、13、37及39，在500 ppm之劑量下觀測到良好保護(至少70%)或完全保護。

實例E：對圓核腔菌(大麥網斑病菌)之活體內測試

藉由在丙酮/吐溫/DMSO之混合物中均質化來製備所測試之活性成份，接著將其以水稀釋以獲得所需活性物質濃度。

在1葉期(10 cm高)，藉由以如上所述製備之活性成份噴

霧來處理在起始杯中播種在50/50泥炭土-火山灰基質上且在12°C下生長之大麥植物(Express變種)。

以不含有活性物質之水溶液處理用作對照之植物。

24小時後，藉由以圓核腔菌孢子之水懸浮液(每毫升12,000個孢子)對植物噴霧使其受污染。自12天培養物收集孢子。將受污染之大麥植物在約20°C及100%相對濕度下培育24小時，且接著在80%相對濕度下培育12天。

在污染後12天，與對照植物相比進行分級。

在該等條件下，使用以下化合物：9、10、11、12、13、21、36、37、38、39、43、44、45、46、51、52、57、60、62、64、65、66、68、69、76及110，在500 ppm之劑量下觀測到良好(至少70%)保護。

實例F：對隱匿柄鏽菌(褐銹病菌)之活體內測試

藉由在丙酮/吐溫/DMSO之混合物中均質化來製備所測試之活性成份，接著將其以水稀釋以獲得所需活性物質。

在1葉期(10 cm高)，藉由以上述水性懸浮液噴霧來處理在起始杯中播種在50/50泥炭土-火山灰基質上且在12°C下生長之小麥植物(Scipion變種)。

以不含有活性物質之水溶液處理用作對照之植物。

24小時後，藉由以隱匿柄鏽菌孢子之水懸浮液(每毫升100,000個孢子)對葉片噴霧使植物受污染。自10天之受污染小麥收集孢子且將其懸浮於含有2.5 ml/l吐溫80(10%)之水中。將受污染之小麥植物在20°C及100%相對濕度下培育24小時，且接著在20°C及70%相對濕度下培育10天。

在污染後10天，與對照植物相比進行分級。

在該等條件下，使用以下化合物：9、37及38，在500 ppm之劑量下觀測到良好保護(至少70%)或完全保護。

實例G：對禾生球腔菌(小麥褐斑病菌)之活體內測試

藉由在丙酮/吐溫/DMSO之混合物中均質化來製備所測試之活性成份，接著將其以水稀釋以獲得所需活性物質濃度。

在1葉期(10 cm高)，藉由以上述水性懸浮液噴霧來處理在起始杯中播種在50/50泥炭土-火山灰基質上且在12°C下生長之小麥植物(Scipion變種)。以不含有活性物質之水溶液處理用作對照之植物。

24小時後，藉由以禾生球腔菌孢子之水性懸浮液(每毫升500 000個孢子)對植物噴霧使其後污染。自7天培養物收集孢子。將受污染之小麥植物在18°C及100%相對濕度下培育72小時，且接著在90%相對濕度下培育21至28天。

在污染後21至28天，與對照植物相比進行分級(功效%)。

在該等條件下，使用以下化合物：9、13、15、21、34、37、39、51、66及74，在500 ppm之劑量下觀測到良好保護(至少70%)或完全保護。

實例H：對粟熱病菌(*Pyricularia grisea*)(稻瘟病菌)之活體內測試

藉由在丙酮/吐溫/DMSO之混合物中均質化來製備所測試之活性成份，接著將其以水稀釋以獲得所需活性物質濃

度。

在2葉期(13-15 cm高)，藉由如上所述製備之活性成份噴霧來處理在起始杯中播種在50/50泥炭土-火山灰基質上且在25°C下生長之水稻植物(Koshihikari變種)。以不含有活性物質之丙酮/吐溫/DMSO/水之混合物處理用作對照之植物。

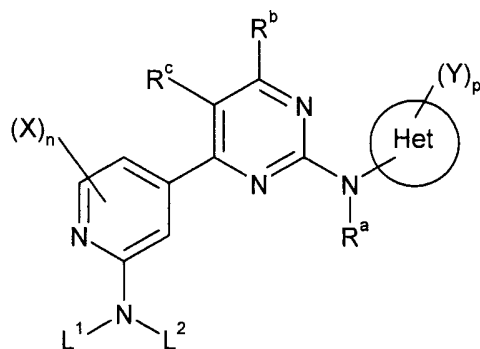
24小時後，藉由以粟熱病菌孢子之水性懸浮液(每毫升30,000個孢子)對植物噴霧使其受污染。自17天之培養物收集孢子且將其懸浮於含有2.5 g/l明膠之水中。將受污染之水稻植物在約25°C及100%相對濕度下培育72小時，且接著在25°C下，在日間80%相對濕度及夜間20%相對濕度下培育3天。

在污染後6天，與對照植物相比進行分級(功效%)。

在該等條件下，使用以下化合物：9，在500 ppm之劑量下觀測到良好保護(至少70%)或完全保護。

五、中文發明摘要：

本發明係關於式(I)之雜環基-嘧啶基-胺基衍生物：

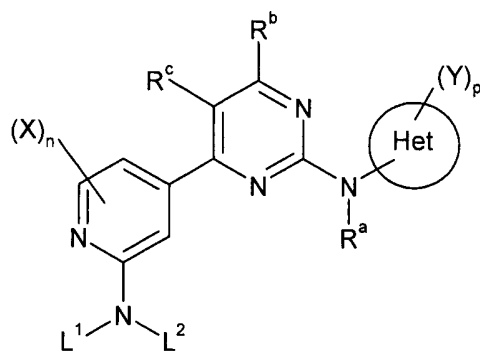


(I)

式(I)之雜環基-嘧啶基-胺基衍生物，其中Het、Y、p、R^a、R^b、R^c、X、n、L¹及L²表示各種取代基；其製備方法；製備中間化合物；其尤其以殺真菌劑組合物之形式作為殺真菌劑活性劑之用途，及使用該等化合物或組合物控制尤其為植物之植物病原性真菌的方法。

六、英文發明摘要：

The present invention relates to heterocycl-yl-pyrimidinyl-amino derivatives of formula (I)

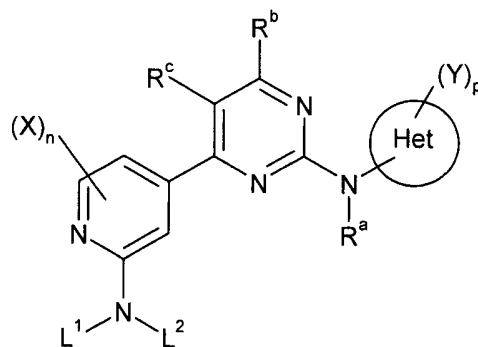


(I)

heterocycl-yl-pyrimidinyl-amino derivatives of formula (I) wherein Het, Y, p, R^a, R^b, R^c, X, n, L¹ and L² represent various substituents, their process of preparation, preparation intermediate compounds, their use as fungicide active agents, particularly in the form of fungicide compositions, and methods for the control of phytopathogenic fungi, notably of plants, using these compounds or compositions.

十、申請專利範圍：

1. 一種式(I)化合物：



(I)

其中：

- Het表示包含至多四個可相同或不同之雜原子的飽和或不飽和，芳族或非芳族4、5、6或7員雜環；
- Y獨立地表示鹵素原子、硝基、羥基、側氧基、氰基、胺基、次磺醯基、五氟- λ^6 -次磺醯基、甲醯基、甲醯氧基、甲醯基胺基、胺甲醯基、N-羥基胺甲醯基、胺基甲酸酯基、(羥基亞胺基)-C₁-C₆烷基、C₁-C₈烷基、三(C₁-C₈烷基)矽烷基、經取代或未經取代之三(C₁-C₈烷基)矽烷基-C₁-C₈烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈環烷基、經取代或未經取代之三(C₁-C₈烷基)矽烷基-C₁-C₈環烷基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代環烷基、C₂-C₈烯基、C₂-C₈炔基、C₂-C₈烯氧基、C₂-C₈炔氧基、C₁-C₈烷基胺基、二C₁-C₈烷基胺基、C₁-C₈烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷氧基、C₁-C₈烷基次磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷基次磺醯基、

C₂-C₈烯氧基、具有1至5個鹵素原子之C₂-C₈鹵代烯氧基、C₃-C₈炔氧基、具有1至5個鹵素原子之C₃-C₈鹵代炔氧基、C₁-C₈烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷基羰基、C₁-C₈烷基胺甲醯基、二C₁-C₈烷基胺甲醯基、N-C₁-C₈烷氧基胺甲醯基、C₁-C₈烷氧基胺甲醯基、N-C₁-C₈烷基-C₁-C₈烷氧基胺甲醯基、C₁-C₈烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷氧基羰基、C₁-C₈烷基羰氧基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷基羰氧基、C₁-C₈烷基羰基胺基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷基羰基胺基、C₁-C₈烷基胺基羰氧基、二C₁-C₈烷基胺基羰氧基、C₁-C₈烷氧基羰氧基、C₁-C₈烷基次磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷基次磺醯基、C₁-C₈烷基亞磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷基亞磺醯基、C₁-C₈烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之C₁-C₈鹵代烷基磺醯基、C₁-C₈烷基胺基胺磺醯基、二C₁-C₈烷基胺基胺磺醯基、(C₁-C₆烷氧基亞胺基)-C₁-C₆烷基、(C₁-C₆烯氧基亞胺基)-C₁-C₆烷基、(C₁-C₆炔氧基亞胺基)-C₁-C₆烷基、2-側氧基吡咯啉-1-基、經取代或未經取代之(苄氧基亞胺基)-C₁-C₆烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷氧基烷基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代烷氧基烷基、經取代或未經取代之苄氧基、經取代或未經取代之苄基次磺醯基、經取代或未經取代之苄基胺基、經取代或未經取代之苄氧基、經

取代或未經取代之苯基次磺醯基或經取代或未經取代之苯基胺基；

- p表示0、1、2、3、4、5或6；
- R^a 表示氫原子、氟基、甲醯基、甲醯氧基、 C_1-C_8 烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷氧基羰基、 C_1-C_8 烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基羰基、 C_1-C_8 烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基磺醯基、 C_1-C_8 烷基、 C_1-C_8 環烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代環烷基、 C_2-C_8 烯基、 C_2-C_8 炔基、 C_1-C_8 烷氧基烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷氧基烷基；
- R^b 及 R^c 獨立地表示氫原子、鹵素原子、氟基、 C_1-C_8 烷基、 C_1-C_8 環烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_8 鹵代環烷基；
- X獨立地表示 C_1-C_{10} 烷基、 C_1-C_{10} 鹵代烷基、鹵素原子或氟基；
- n表示0、1、2或3；
- L^1 及 L^2 獨立地表示氫原子、氟基、羥基、胺基、甲醯基、甲醯氧基、甲醯基胺基、胺甲醯基、N-羥基胺甲醯基、胺基甲酸酯基、經取代或未經取代之(羥基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基、三(C_1-C_8 烷基)矽烷基、經取代或未經取代之三(C_1-C_8 烷基)矽烷基- C_1-C_8 烷基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 環

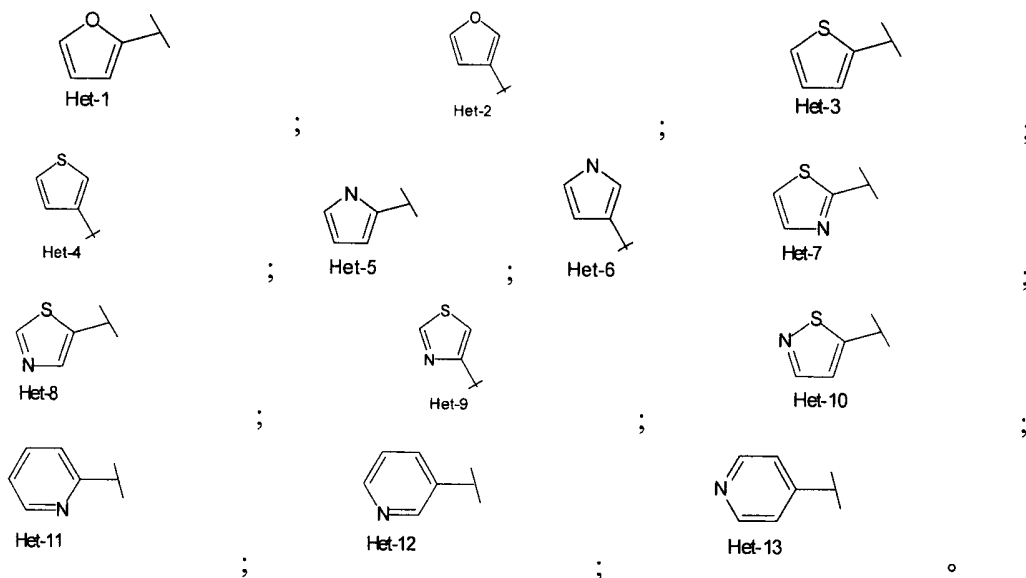
烷基、經取代或未經取代之三(C₁-C₈烷基)矽烷基-C₁-C₈環烷基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代環烷基、C₂-C₈烯基、經取代或未經取代之C₂-C₈炔基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷基胺基、經取代或未經取代之二C₁-C₈烷基胺基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代烷氧基、經取代或未經取代之C₂-C₈烯氧基、經取代或未經取代之C₂-C₈炔氧基、經取代或未經取代之C₂-C₈烯氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₂-C₈鹵代烯氧基、經取代或未經取代之C₃-C₈炔氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₃-C₈鹵代炔氧基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代烷基羰基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷基胺甲醯基、經取代或未經取代之二C₁-C₈烷基胺甲醯基、經取代或未經取代之N-C₁-C₈烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之N-C₁-C₈烷基-C₁-C₈烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代烷氧基羰基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷基羰氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代烷基羰氧基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷基羰基胺基、具有1

至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基羰基胺基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基胺基羰氧基、經取代或未經取代之二 C_1-C_8 烷基胺基羰氧基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷氧基羰氧基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基次磺醯基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基次磺醯基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基亞磺醯基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基亞磺醯基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基磺醯基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基胺基胺磺醯基、經取代或未經取代之二 C_1-C_8 烷基胺基胺磺醯基、經取代或未經取代之(C_1-C_6 烷氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、經取代或未經取代之(C_1-C_6 烯氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、經取代或未經取代之(C_1-C_6 炔氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基、(2-側氧基吡咯啉-1-基) C_1-C_8 烷基、具有1至5個鹵素原子之(2-側氧基吡咯啉-1-基) C_1-C_8 鹵代烷基、(2-側氧基哌啉-1-基) C_1-C_8 烷基、具有1至5個鹵素原子之(2-側氧基哌啉-1-基) C_1-C_8 鹵代烷基、(2-側氧基氮雜環庚烷-1-基) C_1-C_8 烷基、具有1至5個鹵素原子之(2-側氧基氮雜環庚烷-1-基) C_1-C_8 鹵代烷基、經取代或未經取代之(苄氧基亞胺基)- C_1-C_6 烷基；

- L^1 及 L^2 可共同形成包含至多4個獨立地選自由N、O、S組成之清單的雜原子之飽和或不飽和、芳族或非芳

族、經取代或未經取代之4、5、6或7員含N之雜環；
 以及其鹽、N-氧化物、金屬錯合物、類金屬錯合物及光
 學活性或幾何異構體；其限制條件為排除以下化合物：
 4-[2-(乙基胺基)-4-吡啶基]-N-[5-(-哌嗪基)-2-吡啶基]-2-
 嘧啶胺。

2. 如請求項1之化合物，其中Het表示選自由以下各基組成
 之清單的飽和或不飽和、芳族或非芳族雜環：



3. 如請求項1或2之化合物，其中Y表示鹵素原子、氰基、
 甲醯基胺基、胺甲醯基、經取代或未經取代之(羥基亞胺
 基)-C₁-C₆烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷基、經取代
 或未經取代之三(C₁-C₈烷基)矽烷基、經取代或未經取代
 之C₁-C₈環烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷氧基、具
 有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代烷氧
 基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵
 代烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷基羰基胺基。

4. 如請求項1或2之化合物，其中Y表示鹵素原子、氰基、

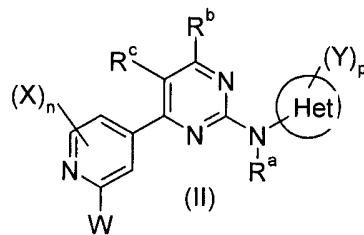
甲醯基胺基、胺甲醯基、經取代或未經取代之(羥基亞胺基)-C₁-C₆烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷基、經取代或未經取代之三(C₁-C₈烷基)矽烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈環烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代烷氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代烷基。

5. 如請求項1或2之化合物，其中p表示0、1或2。
6. 如請求項1或2之化合物，其中p表示1。
7. 如請求項1或2之化合物，其中R^a表示氫原子。
8. 如請求項1或2之化合物，其中R^b及R^c獨立地表示氫原子或鹵素原子。
9. 如請求項1或2之化合物，其中R^b及R^c獨立地表示氫原子。
10. 如請求項1或2之化合物，其中n表示0。
11. 如請求項1或2之化合物，其中L¹及L²獨立地表示氫原子、氟基、羥基、胺基、甲醯基、甲醯氧基、甲醯基胺基、經取代或未經取代之(羥基亞胺基)-C₁-C₆烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷基、三(C₁-C₈烷基)矽烷基、經取代或未經取代之C₁-C₈環烷基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代烷基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之C₁-C₈鹵代環烷基、C₂-C₈烯基、經取代或未經取代之C₂-C₈炔基、經取代或未經取代之C₁-C₈烷基胺基、經取代或未經取代之二C₁-C₈烷基胺

基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷氧基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基羰基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基胺甲醯基、經取代或未經取代之二 C_1-C_8 烷基胺甲醯基、經取代或未經取代之 $N-C_1-C_8$ -烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之 $N-C_1-C_8$ 烷基- C_1-C_8 烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷氧基羰基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基羰氧基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基羰氧基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基羰基胺基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基羰基胺基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基胺基羰氧基、經取代或未經取代之二 C_1-C_8 烷基胺基羰氧基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷氧基羰氧基、經取代或未經取代之 C_1-C_8 烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之經取代或未經取代之 C_1-C_8 鹵代烷基磺醯基、(2-側氧基吡咯啉-1-基) C_1-C_8 烷基、具有1至5個鹵素原子之(2-側氧基吡咯啉-1-基) C_1-C_8 鹵代烷基、(2-側氧基哌啉-1-基) C_1-C_8 烷基、具有1至5個鹵素原子之(2-側氧基哌啉-1-基) C_1-C_8 鹵代烷基、(2-側氧基氮雜環庚烷-1-基) C_1-C_8 烷基、具有1至5個鹵素原子之(2-側氧基氮雜環庚烷-1-基) C_1-C_8 鹵代烷基；

當 L^1 與 L^2 共同形成包含至多4個選自由N、O、S組成之清單的雜原子之經取代或未經取代之4、5、6或7員雜環時， L^1 及 L^2 獨立地表示經取代或未經取代之2-側氧基吡咯啉-1-基或經取代或未經取代之2-側氧基-1,3-噁唑啉-3-基。

12. 如請求項1或2之化合物，其中 L^1 及 L^2 獨立地表示氫原子，或直鏈或支鏈之經取代或未經取代之 C_1 - C_8 烷基。
13. 如請求項1或2之化合物，其中 L^1 及 L^2 獨立地表示氫原子，或直鏈或支鏈之經取代或未經取代之 $(C_1$ - C_8 烷基)- C_1 - C_8 烷基。
14. 一種式(II)化合物：



其中：

- W表示離去基，諸如鹵素原子、 C_1 - C_6 烷基磺酸酯基、 C_1 - C_6 鹵烷基磺酸酯基；經取代或未經取代之苯基磺酸酯基；且
- X、Y、n、p、 R^a 、 R^b 、 R^c 、Het係如請求項1至13中任一項所定義。

15. 一種殺真菌劑組合物，其包含作為活性成份之有效量之如請求項1至13中任一項之式(I)化合物及農業上可接受之載體、載劑或填充劑。

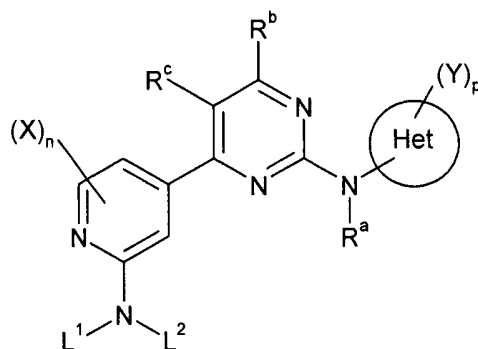
16. 一種控制作物之植物病原性真菌的方法，其特徵在於向植物生長或能夠生長之土壤，向植物之葉或果實，或向植物之種子施用農藝學上有效且實質上無植物毒性量之如請求項1至13中任一項之化合物或如請求項15之組合物。

七、指定代表圖：

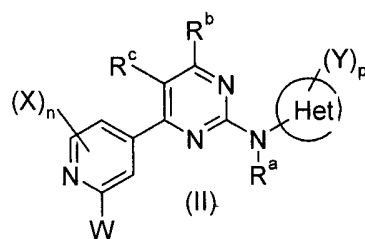
(一)本案指定代表圖為：(無)

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



(I)



(II)