



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201245155 A1

(43)公開日：中華民國 101 (2012) 年 11 月 16 日

(21)申請案號：100130635

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 08 月 26 日

(51)Int. Cl. : **C07D231/38 (2006.01)**

A01N43/56 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

(30)優先權：2010/09/01 美國

61/379,159

(71)申請人：杜邦股份有限公司 (美國) E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY (US)
美國

(72)發明人：龍 傑佛瑞 凱司 LONG, JEFFREY KEITH (US)；哈南崗 瑪麗 安 HANAGAN, MARY ANN (US)；馬雪爾 艾瑞克 亞倫 MARSHALL, ERIC ALLEN (US)；雪佩 波拉 路易絲 SHARPE, PAULA LOUISE (US)；丁 愛咪 X DING, AMY X. (US)

(74)代理人：陳傳岳；郭雨嵐

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：20 項 圖式數：0 共 202 頁

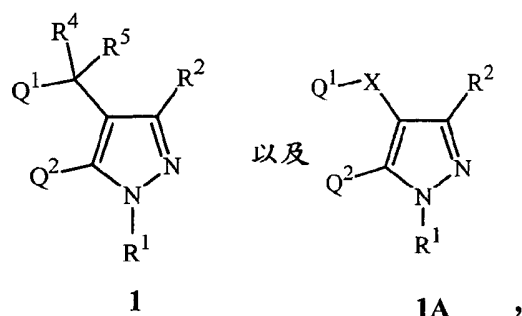
(54)名稱

殺真菌吡唑

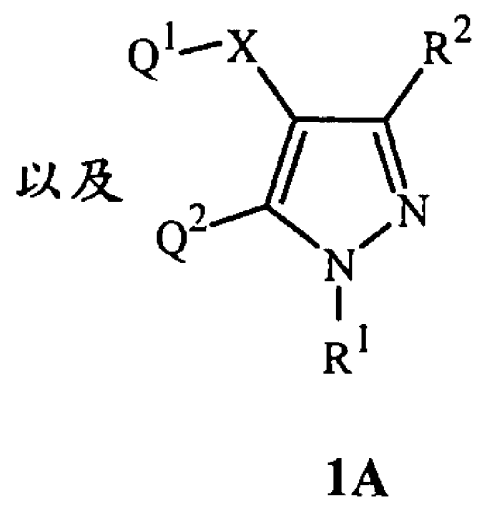
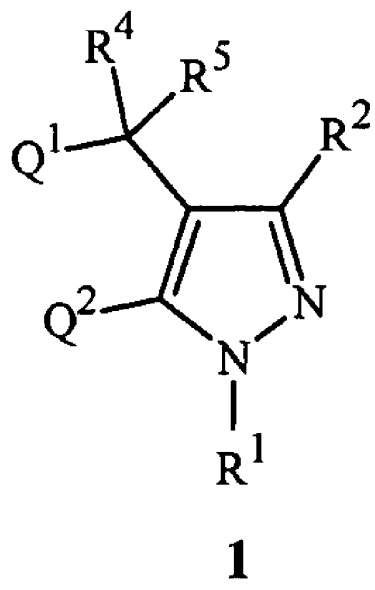
FUNGICIDAL PYRAZOLES

(57)摘要

所揭露者為式 1 與式 1A 化合物，包括所有立體異構物、其 N-氧化物及其鹽類，



其中 Q^1 、 Q^2 、 R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 與 X 係如本揭露中所定義。亦揭露者為含有式 1 或式 1A 化合物之組成物與用於防治由真菌類植物病原體造成之植物病害的方法，其包含施予一般真菌有效量之本發明化合物或組成物。





(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201245155 A1

(43)公開日：中華民國 101 (2012) 年 11 月 16 日

(21)申請案號：100130635

(22)申請日：中華民國 100 (2011) 年 08 月 26 日

(51)Int. Cl. : **C07D231/38 (2006.01)**

A01N43/56 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

(30)優先權：2010/09/01 美國

61/379,159

(71)申請人：杜邦股份有限公司 (美國) E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY (US)
美國

(72)發明人：龍 傑佛瑞 凱司 LONG, JEFFREY KEITH (US)；哈南崗 瑪麗 安 HANAGAN, MARY ANN (US)；馬雪爾 艾瑞克 亞倫 MARSHALL, ERIC ALLEN (US)；雪佩 波拉 路易絲 SHARPE, PAULA LOUISE (US)；丁 愛咪 X DING, AMY X. (US)

(74)代理人：陳傳岳；郭雨嵐

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：20 項 圖式數：0 共 202 頁

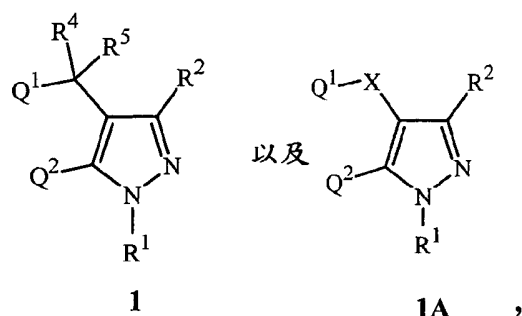
(54)名稱

殺真菌吡唑

FUNGICIDAL PYRAZOLES

(57)摘要

所揭露者為式 1 與式 1A 化合物，包括所有立體異構物、其 N-氧化物及其鹽類，



其中 Q^1 、 Q^2 、 R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 與 X 係如本揭露中所定義。亦揭露者為含有式 1 或式 1A 化合物之組成物與用於防治由真菌類植物病原體造成之植物病害的方法，其包含施予一般真菌有效量之本發明化合物或組成物。

六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於某些吡唑、其 *N*-氧化物、鹽類及組成物，及其作為殺真菌劑用途之方法。

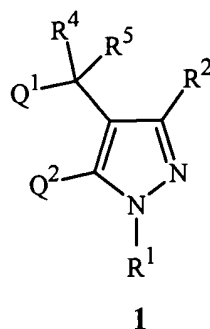
【先前技術】

防治真菌類植物病原造成之植物疾病對於達成高作物產率係極為重要的。對於觀賞植物、蔬菜作物、田間作物、穀類作物及水果作物的植物疾病損害會造成產量明顯減少，因此導致增加成本轉嫁到消費者。有許多針對此目的之市售產品，但仍持續有對於更有效、更低成本、更小毒性、對環境較更安全或具有不同作用點之新穎化合物有需求。

PCT 專利公開案第 WO 2009/007098 A1 號揭露某些作為殺真菌劑之吡唑衍生物。

【發明內容】

本發明係針對式 1 化合物（包括所有立體異構物）、其 *N*-氧化物及其鹽類、含有它們之農業組成物及其作為殺真菌劑之用途：



其中

Q^1 為一經 1 至 5 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；

Q^2 為一經 1 至 5 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；或一 5 至 6 員完全不飽和雜環，各環含有選自碳原子與 1 至 3 個雜原子之環員，該雜原子係獨立選自至多 2 個 O、至多 2 個 S 與至多 3 個 N 原子，其中至多 2 個碳環員係獨立選自 C(=O) 與 C(=S)，各環係選擇性地經至多 5 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} 的取代基取代；

R^1 為 C_1 - C_2 烷基、鹵甲基、氰甲基或環丙基；

R^2 為 H、鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_2 - C_3 氰烷基、 C_1 - C_2 羥烷基、環丙基、鹵環丙基、 C_2 - C_3 烷氧烷基、 C_1 - C_2 烷硫基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、羥基、硝基、胺基、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、 C_4 - C_6 烷環烷基、 C_4 - C_6 環烷烷基、 C_1 - C_3 烷硫基、 C_1 - C_3 鹵烷硫基、 C_1 - C_3 烷亞磺醯基、 C_1 - C_3 鹵烷亞磺醯基、 C_1 - C_3 烷磺醯基、 C_1 - C_3 鹵烷磺醯基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 鹵烷氧基、 C_3 - C_6 環烷氧基、 C_1 - C_3 烷磺醯氧基、 C_1 - C_3 鹵烷磺醯氧基、 C_2 - C_4 烷羰氧基、 C_2 - C_4 烷羰基、 C_1 - C_3 烷胺基、 C_2 - C_4 二

烷胺基、 C_2-C_4 烷羰胺基、 $-CH(=O)$ 、 $-NHCH(=O)$ 、 $-SF_5$ 、 $-SC\equiv N$ 或 $-U-V-T$ ；

各 R^{3b} 獨立為氰基、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_2-C_4 烷氧烷基、 C_2-C_4 烷胺烷基、 C_3-C_4 二烷胺烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_2-C_4 烷羰基或 C_2-C_4 烷氧羰基；

R^4 為鹵素、 $-OR^7$ 或 $-SC\equiv N$ ；

R^5 為 H 或 C_1-C_4 烷基；

R^7 為 H、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_2-C_6 氰烷基、 C_2-C_6 烷氧烷基、 $-CH(=O)$ 、 $-S(=O)_2OM^1$ 或 $-C(=W)R^9$ ；

R^9 為 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烷氧烷基、 C_2-C_6 烷胺烷基、 C_3-C_6 二烷胺烷基、 C_2-C_6 烷硫烷基、 C_1-C_6 烷氧基或 C_1-C_6 烷硫基；

各 U 獨立為 O、 $S(=O)_n$ 、 $N(R^{10})$ 或一直接鍵；

各 V 獨立為 C_1-C_6 伸烷基、 C_2-C_6 伸烯基、 C_3-C_6 伸炔基、 C_3-C_6 伸環烷基或 C_3-C_6 伸環烯基，其中至多 3 個碳原子係獨立選自 $C(=O)$ ，各選擇性地經至多 5 個獨立選自鹵素、氰基、硝基、羥基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_1-C_6 烷氧基與 C_1-C_6 鹵烷氧基之取代基取代；

各 T 獨立為氰基、 $N(R^{11a})(R^{11b})$ 、 OR^{12} 或 $S(=O)_nR^{12}$ ；

各 R^{10} 獨立為 H、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 烷羰基、 C_2-C_6 烷氧羰基、 C_2-C_6 (烷硫基)羰基、 C_2-C_6 烷氧基(硫羰基)、 C_4-C_8 環烷羰基、 C_4-C_8

環烷氧羰基、C₄-C₈(環烷硫基)羰基或 C₄-C₈ 環烷氧基(硫羰基)；

各 R^{11a} 與 R^{11b} 獨立為 H、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₂-C₆ 烯基、C₃-C₆ 炔基、C₃-C₆ 環烷基、C₃-C₆ 鹵環烷基、C₂-C₆ 烷羰基、C₂-C₆ 烷氧羰基、C₂-C₆ (烷硫基)羰基、C₂-C₆ 烷氧基(硫羰基)、C₄-C₈ 環烷羰基、C₄-C₈ 環烷氧羰基、C₄-C₈ (環烷硫基)羰基或 C₄-C₈ 環烷氧基(硫羰基)；或

一對 R^{11a} 與 R^{11b} 係與其所連接之氮原子一起形成一 3 至 6 員雜環，該環係選擇性地經至多 5 個獨立選自 R¹³ 之取代基取代；

各 R¹² 獨立為 H、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₂-C₆ 烯基、C₃-C₆ 炔基、C₃-C₆ 環烷基、C₃-C₆ 鹵環烷基、C₂-C₆ 烷羰基、C₂-C₆ 烷氧羰基、C₂-C₆ (烷硫基)羰基、C₂-C₆ 烷氧基(硫羰基)、C₄-C₈ 環烷羰基、C₄-C₈ 環烷氧羰基、C₄-C₈ (環烷硫基)羰基或 C₄-C₈ 環烷氧基(硫羰基)；

各 R¹³ 獨立為鹵素、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 鹵烷基或 C₁-C₆ 烷氧基；

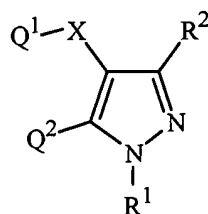
W 為 O 或 S；

M¹ 為 K、Na 或 Li；以及

各 n 獨立為 0、1 或 2；

其限制條件是當 Q² 為一苯環且未經 R^{3a} 在鄰位取代，則 Q¹ 係經至少一個 R^{3a} 在一鄰位取代。

本發明亦針對式 1A 化合物（包括所有立體異構物）、其 *N*-氧化物及其鹽類、含有它們之農業組成物及其作為殺真菌劑之用途：



1A

其中

Q^1 為一經 1 至 5 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；

Q^2 為一經 1 至 5 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；或一 5 至 6 員完全不飽和之雜環，各環含有選自碳原子與 1 至 3 個雜原子之環員，該雜原子係獨立選自至多 2 個 O、至多 2 個 S 與至多 3 個 N 原子，其中至多 2 個碳環員係獨立選自 C(=O) 與 C(=S)，各環係選擇性地經至多 5 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} 的取代基取代；

X 為 O、S(O)_m、N(R⁶) 或 C(=O)；

R^1 為 C₁-C₂ 烷基、鹵甲基、氰甲基或環丙基；

R^2 為 H、鹵素、氰基、C₁-C₂ 烷基、C₂-C₄ 烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₂-C₃ 氰烷基、C₁-C₂

羥烷基、環丙基、鹵環丙基、C₂-C₃ 烷氧烷基、
 C₁-C₂ 烷硫基、C₁-C₂ 烷氧基或 C₁-C₂ 鹵烷氧基；
 各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、羥基、硝基、胺基、C₁-C₃
 烷基、C₂-C₄ 烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₃ 鹵烷基、
 C₃-C₆ 環烷基、C₃-C₆ 鹵環烷基、C₄-C₆ 烷環烷
 基、C₄-C₆ 環烷烷基、C₁-C₃ 烷硫基、C₁-C₃ 鹵
 烷硫基、C₁-C₃ 烷亞磺醯基、C₁-C₃ 鹵烷亞磺醯
 基、C₁-C₃ 烷磺醯基、C₁-C₃ 鹵烷磺醯基、C₁-C₃
 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基、C₃-C₆ 環烷氧基、C₁-C₃
 烷磺醯氧基、C₁-C₃ 鹵烷磺醯氧基、C₂-C₄ 烷羧
 氧基、C₂-C₄ 烷羧基、C₁-C₃ 烷胺基、C₂-C₄ 二
 烷胺基、C₂-C₄ 烷羧胺基、-CH(=O)、
 -NHCH(=O)、-SF₅、-SC≡N 或 -U-V-T；

各 R^{3b} 獨立為氰基、C₁-C₃ 烷基、C₂-C₄ 烯基、C₂-C₄
 炔基、C₃-C₆ 環烷基、C₂-C₄ 烷氧烷基、C₂-C₄
 烷胺烷基、C₃-C₄ 二烷胺烷基、C₁-C₃ 烷氧基、
 C₂-C₄ 烷羧基或 C₂-C₄ 烷氧羧基；

R⁶ 為 H、羥基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₂-C₆
 烯基、C₂-C₆ 炔基、C₃-C₆ 環烷基、C₂-C₆ 烷氧
 烷基、C₂-C₆ 氰烷基、NH₂、-CH(=O)、-OR⁷、
 -OS(=O)₂M¹、-S(=O)_nR⁸ 或 -C(=W)R⁹；

R⁷ 為 C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₂-C₆ 烯基、C₃-C₆
 炔基、C₃-C₆ 環烷基、C₂-C₆ 氰烷基、C₂-C₆ 烷
 氧烷基、-CH(=O)、-S(=O)₂OM¹ 或 -C(=W)R⁹；

R⁸ 為 C₁-C₆ 烷基或 C₁-C₆ 鹵烷基；

R^9 為 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烷氧烷基、 C_2-C_6 烷胺烷基、 C_3-C_6 二烷胺烷基、 C_2-C_6 烷硫烷基、 C_1-C_6 烷氧基或 C_1-C_6 烷硫基；

各 U 獨立為 O 、 $S(=O)_n$ 、 $N(R^{10})$ 或一直接鍵；

各 V 獨立為 C_1-C_6 伸烷基、 C_2-C_6 伸烯基、 C_3-C_6 伸炔基、 C_3-C_6 伸環烷基或 C_3-C_6 伸環烯基，其中至多 3 個碳原子係獨立選自 $C(=O)$ ，各選擇性地經至多 5 個獨立選自鹵素、氰基、硝基、羥基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_1-C_6 烷氧基與 C_1-C_6 鹵烷氧基之取代基取代；

各 T 獨立為氰基、 $N(R^{11a})(R^{11b})$ 、 OR^{12} 或 $S(=O)_nR^{12}$ ；

各 R^{10} 獨立為 H 、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 烷羰基、 C_2-C_6 烷氧羰基、 C_2-C_6 (烷硫基)羰基、 C_2-C_6 烷氧基(硫羰基)、 C_4-C_8 環烷羰基、 C_4-C_8 環烷氧羰基、 C_4-C_8 (環烷硫基)羰基或 C_4-C_8 環烷氧基(硫羰基)；

各 R^{11a} 與 R^{11b} 獨立為 H 、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_3-C_6 鹵環烷基、 C_2-C_6 烷羰基、 C_2-C_6 烷氧羰基、 C_2-C_6 (烷硫基)羰基、 C_2-C_6 烷氧基(硫羰基)、 C_4-C_8 環烷羰基、 C_4-C_8 環烷氧羰基、 C_4-C_8 (環烷硫基)羰基或 C_4-C_8 環烷氧基(硫羰基)；或

一對 R^{11a} 與 R^{11b} 係與其所連接之氮原子一起形成一 3 至 6 員雜環，該環係選擇性地經至多 5 個獨立選自 R^{13} 之取代基取代；

各 R^{12} 獨立為 H、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_3 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、 C_2 - C_6 烷羰基、 C_2 - C_6 烷氧羰基、 C_2 - C_6 (烷硫基)羰基、 C_2 - C_6 烷氧基(硫羰基)、 C_4 - C_8 環烷羰基、 C_4 - C_8 環烷氧羰基、 C_4 - C_8 (環烷硫基)羰基或 C_4 - C_8 環烷氧基(硫羰基)；

各 R^{13} 獨立為鹵素、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基或 C_1 - C_6 烷氧基；

W 為 O 或 S；

M^1 為 K、Na 或 Li；

m 為 0、1 或 2；及

各 n 獨立為 0、1 或 2；

其限制條件為：

(a) 當 Q^2 為一苯環且未經 R^{3a} 在鄰位取代，則 Q^1 係經至少一個 R^{3a} 在一鄰位取代；並且

(b) 該化合物非為 1-[2-[4-(2,4-二氯苯甲醯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]苯基]乙酮。

更特定的是，此發明關於一選自式 1 化合物（包括所有立體異構物）、其一 *N*-氧化物或其一鹽之化合物；或一選自式 1A 化合物（包括所有立體異構物）、其一 *N*-氧化物或其一鹽之化合物。

本發明亦關於一殺真菌組成物，其包含(a)一本發明之化合物（即以一殺真菌有效量）；以及(b)至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑與液體稀釋劑所組成之群組的額外組分。

本發明亦關於一殺真菌組成物，其包含(a)本發明之一化合物；以及(b)至少一種其他殺真菌劑（例如至少一種具有一不同作用位點之其他殺真菌劑）。

該發明進一步關於一種用於防治由真菌類植物病原體造成之植物病害的方法，其包含施予該植物或其部分或該植物種子一殺真菌有效量之一本發明化合物（例如作為一本文中所述組成物）。

【實施方式】

如本文中所使用，用語「包含」、「包括」、「具有」、「含有」、「特徵為」或其任何其他的變化，係意欲涵蓋非排他性的涵括，並受到任何明確表示的限制。例如，包含元素列表的組成物、混合物、製程、方法、物品或裝置不必僅限於那些元素，而是可以包括未明確列出的或該組成物、混合物、製程、方法、物品或裝置所固有的其他元素。

連接詞「由……組成」則排除任何未明確說明的元素、步驟或成分。如果是在申請專利範圍中，這樣的用詞將會封閉申請專利範圍，使其除了在通常會與其相關的雜質之外，不包括那些在列舉以外的物質。當該連接詞「由……組成」出現在申請專利範圍主體的子句，而非緊接著序言，其只限制在該子句中提到的元素；其他元素總體上不會從申請專利範圍中被排除。

連接詞「主要由……組成」係用於界定一組成物、方法或裝置，其包括明文揭示者以外之材料、步驟、特徵、組件或元件，其限制條件是這些額外之材料、步驟、

特徵、組件或元件不會顯著影響所主張發明之基本與新穎特徵。用語「主要由……組成」居於「包含」與「由……組成」之間的中間地帶。

若申請人以開放式用語如「包含」定義一發明或其部分，則表示（除非另有說明）該敘述應解讀為亦以「主要由……所組成」或「由……所組成」描述該發明。

此外，除非有相反的明確說明，「或」是指涵括性的「或」，而不是指排他性的「或」。例如，以下任何一種情況均滿足條件 A 或 B：A 是真實的（或存在的）且 B 是虛假的（或不存在的），A 是虛假的（或不存在的）且 B 是真實的（或存在的），以及 A 和 B 都是真實的（或存在的）。

同樣地，位於本發明之元素或成份之前的不定冠詞「一」及「一個」旨在非限制性地說明該元素或成份的實例數目（即出現數）。因此「一」或「一個」應理解為包括一個或至少一個，且該元素或成分的單數詞形也包括複數，除非該數目顯然是指單數。

如本揭露內容及申請專利範圍中所提到，「植物」包括植物界的成員，特別是所有生命階段的種子植物(spermatopsida)，包括幼嫩植物（如發芽種子發育成為幼苗）及成熟生殖階段（如產生花及種子的植物）。植物上的部分包括通常在生長介質表面（如土壤）下生長的向地部分，像是根、塊莖、鱗莖和球莖，以及在生長介質上生長的部分，像是葉子（包括莖及葉）、花、果實和種子。

如本文中所提到，用語「幼苗」，無論是單獨使用或與其他字詞組合使用，意指從一種子胚芽發育的幼嫩植物。

如本文中所指者，用語「闊葉」無論是單獨使用或與其他字詞組合使用例如「闊葉作物」，其意指雙子葉或雙子葉植物，一種用於描述一群特徵為胚具有兩個子葉之被子植物。

如本文中所用者，用語「烷化劑」係指一種化合物，在其中一含碳自由基係透過一碳原子鍵結至一脫離基如鹵化物或是磺酸鹽，其可藉由鍵結一親核劑至前述之碳原子來置換。除非另有指明，用語「烷化劑」未將該含碳自由基限制為烷基；在烷化劑中之含碳自由基包括各式碳鍵結取代基之自由基，其例如指定為用於 R^1 與 Q^1 者。

在上述說明中，用語「烷基」無論是單獨使用或使用於化合物字詞如「烷硫基」或「鹵烷基」中，其包括直-鏈或支鏈烷基如甲基、乙基、正丙基、異丙基或不同之丁基、戊基或己基異構物。「烯基」包括直鏈或支鏈烯類如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基與不同之丁烯基、戊烯基與己烯基異構物。「烯基」亦包括多烯如 1,2-丙二烯基與 2,4-己二烯基。「炔基」包括直鏈或支鏈炔類如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基與不同之丁炔基、戊炔基與己炔基異構物。「炔基」亦可包括由多重三鍵所構成之部分(moiety)如 2,5-己二炔基。「伸烷基」代表一直鏈或支鏈烷二基。「伸烷基」之實例包括 CH_2 、 CH_2CH_2 、 $CH(CH_3)$ 、 $CH_2CH_2CH_2$ 、 $CH_2CH(CH_3)$ 與不同之伸丁基、

伸戊基或伸己基異構物。「伸烯基」代表一直鏈或支鏈之烯二基，其含有一個烯鍵。「伸烯基」之實例包括 $\text{CH}=\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$ 與 $\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)$ 。「伸炔基」代表一直鏈或支鏈炔二基，其含有一個三鍵。「伸炔基」之實例包括 $\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ 與不同之伸丁炔基、伸戊炔基或伸己炔基異構物。

用語「環烷基」代表一飽和碳環，其由 3 至 7 個彼此以單鍵連結之碳原子所組成。「環烷基」之實例包括環丙基、環丁基、環戊基與環己基。用語「烷環烷基」代表在一環烷基基團上之烷基取代，並且包括如乙環丙基、異丙環丙基與甲環戊基。用語「環烷烷基」代表在一烷基部分上之環烷基取代。「環烷烷基」之實例包括環丙甲基、環戊乙基和其他鍵結到直鏈或支鏈烷基基團的環烷基部分。用語「環烷環烷基」代表在另一環烷基環上之環烷基取代，其中每個環烷基環獨立具有 3 到 7 個碳原子環員。「環烷基環烷基」之實例包括環丙環丙基（例如 1,1'-雙環丙基-1-基、1,1'-雙環丙基-2-基）、環己環戊基（例如 4-環戊環己基）與環己環己基（例如 1,1'-雙環己基-1-基）與不同之順式及反式環烷基環烷基異構物，（例如 (1*R*,2*S*)-1,1'-雙環丙基-2-基與 (1*R*,2*R*)-1,1'-雙環丙基-2-基）。用語「環烷氧基」代表連接至一氧原子與經由一氧原子連結之環烷基，其包括如環戊氧基與環己氧基。「環烷羰基」代表鍵結至一 $\text{C}(=\text{O})$ 基團之環烷基，其包含如環丙羰基與環戊羰基。用語「環烷氧羰基」意指鍵結至一 $\text{C}(=\text{O})$ 基團之環烷氧基，例如環丙氧羰基與環戊氧羰基。用語「環伸烷基」意指環烷

二基環。「伸環烷基」之實例包括伸環丙基、伸環丁基、伸環戊基和伸環己基。用語「伸環烯基」代表一含有一個烯鍵之環烯二基環。「伸環烯基」之實例包括伸環丙烯基、伸環丁烯基與伸環戊烯基。

「烷氧基」包括如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基與不同之丁氧基、戊氧基與己氧基異構物。「烷胺基」包括一經直鏈或支鏈烷基取代之 NH 自由基。「烷胺基」之實例包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NH}$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}$ 與 $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}_2\text{NH}$ 。「烷硫基」包括支鏈或直鏈烷硫基部分如甲硫基、乙硫基與不同之丙硫基、丁硫基、戊硫基與己硫基異構物。「烷亞磺醯基」包括一烷亞磺醯基基團之兩種鏡像異構物。「烷亞磺醯基」之實例包括 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(=\text{O})$ 與不同之乙亞磺醯基或丙亞磺醯基異構物。「烷磺醯基」之實例包括 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(=\text{O})_2$ 與不同之乙磺醯基或丙磺醯基異構物。用語「烷磺醯氧基」代表連接至一氧原子或經由一氧原子連結之烷磺醯基。「烷磺醯氧基」包括 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2\text{O}$ 與 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2\text{O}$ 。

「烷氧烷基」代表在烷基上之烷氧基取代。「烷氧烷基」之實例包括 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 與 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 。「烷硫烷基」代表在烷基上之烷硫基取代。「烷硫烷基」之實例包括 CH_3SCH_2 、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 與 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 。「烷胺烷基」代表在烷基上之烷胺基

取代。「烷胺烷基」之實例包括 CH_3NHCH_2 、 $\text{CH}_3\text{NHCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_2$ 與 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_2$ 。「二烷胺烷基」之實例包括 $(\text{CH}_3\text{CH})_2\text{NCH}_2$ 與 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NCH}_2\text{CH}_2$ 。

「氰烷基」代表一經一個氰基基團取代之烷基基團。「氰烷基」之實例包括 NCCH_2 (在本文中亦稱為「氰甲基」)、 NCCH_2CH_2 與 $\text{CH}_3\text{CH}(\text{CN})\text{CH}_2$ 。「羥烷基」代表一經一個羥基基團取代之烷基基團。「羥烷基」之實例包括 HOCH_2 (本文中亦稱為「羥甲基」) 與 HOCH_2CH_2 。

「烷羰基」代表一直鏈或支鏈烷基基團，其鍵結至一 $\text{C}(=\text{O})$ 部分。「烷羰基」之實例包含 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})$ 與 $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})$ 。「烷氧羰基」之實例包括 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$ 與不同之戊氧基-或己氧羰基異構物。用語「烷羰氧基」代表鍵結至一 $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ 部分之直鏈或支鏈烷基。「烷羰氧基」之實例包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{O}$ 與 $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})\text{O}$ 。「烷氧基(硫羰基)」代表一鍵結至一 $\text{C}(=\text{S})$ 部分之直鏈或支鏈烷氧基基團。「烷氧基(硫羰基)」之實例包括 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{S})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{S})$ 與 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{S})$ 。「(烷硫基)羰基」代表一直鏈或支鏈烷硫基基團，其鍵結至一 $\text{C}(=\text{O})$ 部分。「(烷硫基)羰基」之實例包括 $\text{CH}_3\text{SC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SC}(=\text{O})$ 與 $(\text{CH}_3)_2\text{CHSC}(=\text{O})$ 。用語「烷羰胺

基」代表鍵結至一 $\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ 部分的烷基。「烷羰胺基」之實例包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ 與 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ 。

用語「鹵素」無論是單獨或在化合物字詞如「鹵甲基」、「鹵烷基」中，或者當使用於描述如「經鹵素取代之烷基」中時，其包括氟、氯、溴或碘。再者，當使用於化合物字詞如「鹵甲基」、「鹵烷基」中，或者當使用於描述如「經鹵素取代之烷基」中時，該甲基或烷基可經相同或不同的鹵素原子予以部分或全部取代。「鹵烷基」或「經鹵素取代之烷基」之實例包括 F_3C 、 ClCH_2 、 CF_3CH_2 與 CF_3CCl_2 。用語「鹵烷氧基」、「鹵烷硫基」、「鹵烷亞磺醯基」、「鹵烷磺醯基」與「鹵環烷基」之定義係類似於用語「鹵烷基」。「鹵烷氧基」之實例包括 CF_3O 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ 、 $\text{F}_2\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 與 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ 。「鹵烷硫基」之實例包括 CF_3S 、 CCl_3S 與 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}$ 。「鹵烷亞磺醯基」之實例包括 $\text{CF}_3\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})$ 與 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(=\text{O})$ 。「鹵烷磺醯基」之實例包括 $\text{CF}_3\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2$ 與 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(=\text{O})_2$ 。「鹵環烷基」之實例包括氯環丙基、氯環丁基與氯環己基。

在一取代基基團中之碳原子總數係以「 $\text{C}_i\text{-C}_j$ 」前綴語指示，其中 i 與 j 為 1 至 8 之數字。例如， $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷磺醯基代表甲磺醯基至丁磺醯基； C_2 烷氧烷基代表 CH_3OCH_2 ； C_3 烷氧烷基代表例如 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 或 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ ；並且 C_4 烷氧烷基代表一經一烷氧基基團取代之烷基基團的各式異構物，其含有總共四個碳原子，實例包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 與 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 。

用語「未經取代」在與一基團例如一環結合使用時，意指該基團不具有任何其一或多個連接至式 1 或式 1A 剩餘部分之附接物以外的取代基。用語「選擇性地經取代」意指取代基的數目可以為零。除非另有說明，選擇性地經取代的基團可經和可容許數目一樣多的可選擇性取代基取代，藉由以非氫取代基在任何可得的碳原子或氮原子上取代氫原子。通常而言，選擇性取代基（當存在時）之數目範圍為 1 至 3。如本文中所用者，用語「選擇性地經取代」係可與詞組「經取代或未經取代」及用語「（未）經取代」互換使用。

選擇性取代基的數目可經表明的限制所限制。例如，詞組「選擇性地經至多 3 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 的取代基取代」意指可存在 0、1、2 或 3 個取代基（若可能之連接點數目許可）。同樣地，詞組「選擇性地經至多 5 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 的取代基取代」意指可存在 0、1、2、3、4 或 5 個取代基，若可用連接點數目許可的話。當對於取代基數目所指定之範圍（例如在展示 1 中 r 為 0 至 4 的整數）超過一環上取代基可用位置之數目時（例如在展示 1 中，在 A-11 之 $(R^v)_r$ 上僅有 2 個位置可用），則將該範圍之上限認定為可用位置之數目。

在一化合物係經一取代基取代且該取代基帶有下列（指示該取代基之數目可超過 1 個）時，該些取代基（當它們超過 1 個）係獨立選自所界定取代基之群組（例如在展示 1 中之 $(R^v)_r$ ，其中 r 為 1、2、3 或 4）。當一可變基團係顯示為選擇性地連接時（例如其中 r 可為

0 之(R^v)_r)，則氫可在該位置上，即使該可變基團之定義中未曾提及。當描述基團上的一或多個位置為「未經取代」或「未取代」時，則氫原子係連接以佔據任何自由價。

除非另有指明，作為式 1 或式 1A 之一組分的一「環」（例如 Q^2 ）為碳環（例如苯基）或雜環（吡啶基）。用語「環員」係指形成一環骨架之原子（例如 C、O、N 或 S）或其他基團（例如 $C(=O)$ 或 $C(=S)$ ）。

用語「非芳族」包括完全飽和以及部分與完全不飽和之環，其限制條件是這些環皆非為芳族。用語「芳族」係指一完全不飽和環之環員係基本上在相同平面，並且具有一垂直於該環平面之 p 軌域，而且 $(4n + 2) \pi$ 電子（其中 n 為正整數）係連接至該環以符合休克耳定則 (Hückel's rule)。用語「完全不飽和雜環」包括芳族與非芳族完全不飽和雜環。

用語「碳環」代表一環，其中形成該環骨架之原子係僅選自碳。當一完全不飽和碳環滿足休克耳定則時，則該環亦稱為一「芳族碳環」。用語「飽和碳環」係指一其骨架由彼此以單鍵連接之碳原子所組成的環；除非另有指明，其餘碳價係由氫原子佔據。

用語「雜環」代表其中形成環骨架之至少一個原子非為碳（例如 N、O 或 S）的環。一雜環典型含有不超過 3 個 N 原子，不超過 2 個 O 原子與不超過 2 個 S 原子。除非另有指明，一雜環可為一飽和、部分飽和或完全不飽和之環。當一完全不飽和雜環滿足休克耳定則時，則該環亦稱為一「雜芳環」或「芳族雜環」。除非

另有指明，雜環可經由任何可用碳或氮（藉由置換該碳或氮上之氫）而連接。

在本發明之上下文中，當 Q^1 或 Q^2 之一例子包含一苯基或一 6 員完全不飽和雜環時，各環之鄰、間與對位係相對於該環與式 1 其餘部分之連接處。

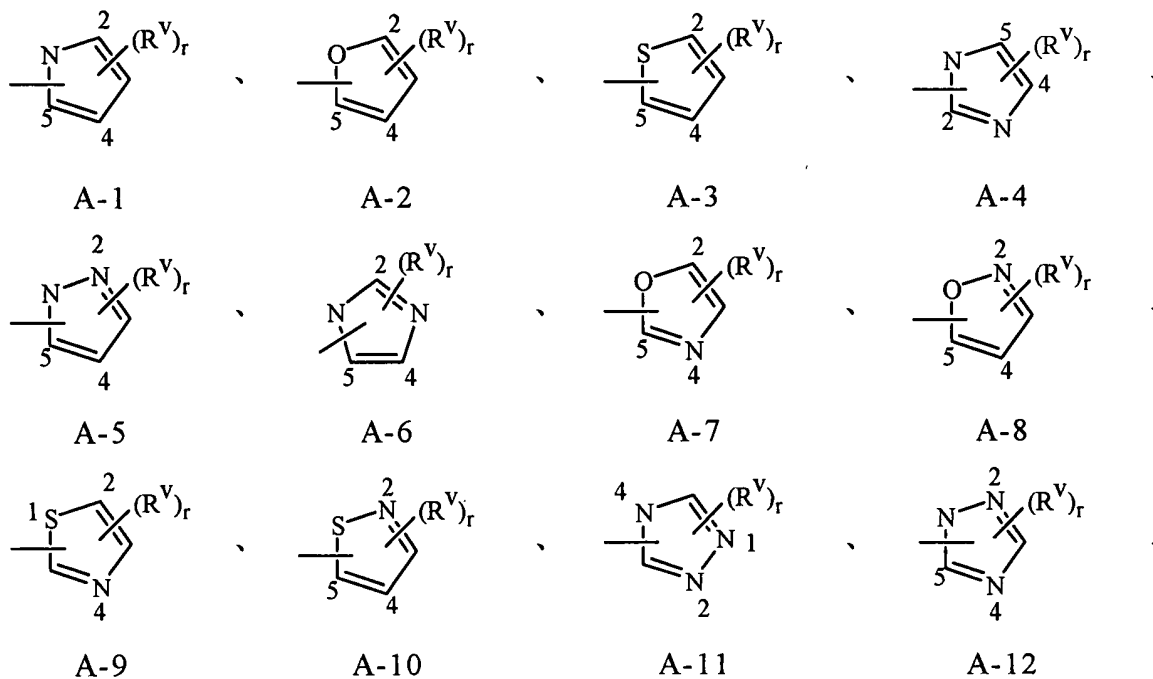
如上所提及者， Q^1 與 Q^2 尤其可為苯基，其選擇性地經 1 至 5 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代。在此情況下，當 Q^1 或 Q^2 之一例子包含一經 4 個或更少個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯基時，則氫原子係連接以佔據任何自由價。

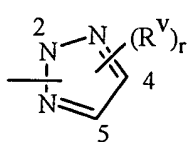
如上所提及者，連接至式 1 或式 1A 之 Q^2 尤其是一 5 或 6 員完全不飽和雜環，各環含有選自碳原子與至多 3 個雜原子之環員，該雜原子係獨立選自至多 2 個 O、至多 2 個 S 與至多 3 個 N 原子，其中至多 2 個碳原子環員係獨立選自 C(=O) 與 C(=S)，各環係選擇性地經至多 5 個獨立選自發明內容對於 Q^2 所界定之任何取代基（即在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} ）取代。因為取代基係選擇性的，可存在 0 至 5 個取代基，僅受到可用連接點數目之限制。在此定義中，該些選自至多 2 個 O、至多 2 個 S 與至多 3 個 N 原子之環員係選擇性的，其限制條件是至少一個環員非為碳（例如 N、O 或 S）。該些氮原子環員可氧化為 N-氧化物，因為關於式 1 或式 1A 之化合物亦包括 N-氧化物衍生物。除了該選自至多 2 個 O、至多 2 個 S 及至多 3 個 N 原子的至多 3 個雜原子之外，尚有選自 C(=O) 及 C(=S) 之至多 2 個碳原子環員。一 5 至 6 員完全不飽和雜環之實例包括

展示 1 中所說明之環 A-1 至 A-31。在展示 1 中之可變 R^v 為發明內容對於 Q^2 所界定之任何取代基（即在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} ）並且 r 為 0 至 4 之整數，其受到各個所述環上可用位置數目之限制。

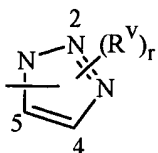
雖然在結構 A-1 至 A-31 中皆顯示有 R^v 基團，但應留意它們不必需存在因為它們是選擇性的取代基。需要取代以填補其價的氮原子係經 H 或 R^v 取代。應留意當 $(R^v)_r$ 與所述環間之連接點係描述為浮動時， $(R^v)_r$ 可連接至任何所述環之可用碳或氮原子。應留意當所述環與式 1 或 1A 其餘部分係描述為浮動時，該環可經由所述環之可用碳或氮連接至式 1 或 1A 之其餘部分（藉由置換一氮原子）。

展示 1

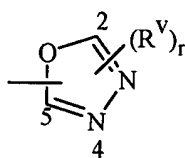




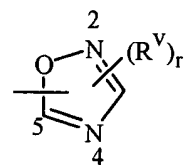
A-13



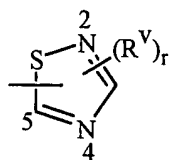
A-14



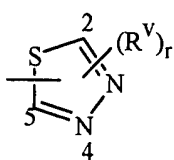
A-15



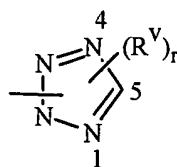
A-16



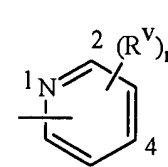
A-17



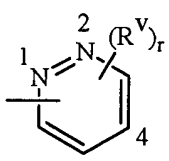
A-18



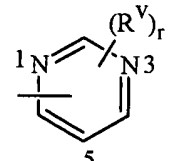
A-19



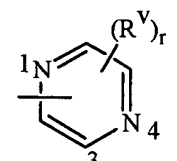
A-20



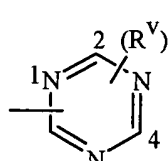
A-21



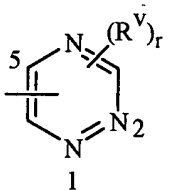
A-22



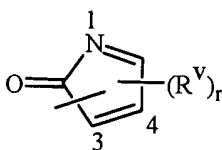
A-23



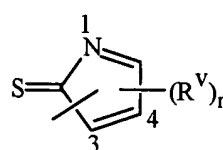
A-24



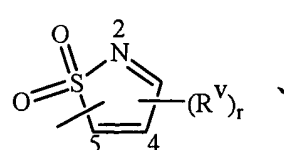
A-25



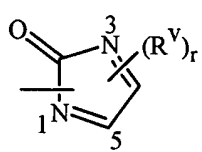
A-26



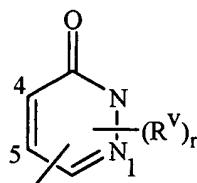
A-27



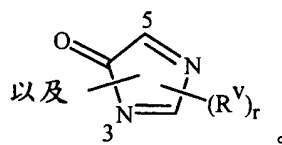
A-28



A-29



A-30



A-31

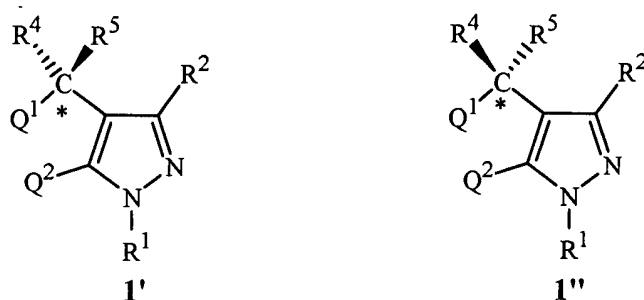
已知在該項技術中有廣泛各式合成方法能夠製備芳族雜環，相關方法的大量回顧請參見八卷集之 *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*，A. R. Katritzky 與 C. W. Rees 主編，Pergamon Press，Oxford, 1984，以及十二卷集之 *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*

II, A. R. Katritzky、C. W. Rees 與 E. F. V. Scriven 主編，Pergamon Press，Oxford，1996。

本發明的化合物可以存在有一個或多個立體異構物。各種立體異構物包括鏡像異構物、非鏡像異構物、阻轉異構物和幾何異構物。熟習該項技術者將明瞭，一個立體異構物當相對於其他立體異構物經濃化或當從其他立體異構物經分離出時，可能活性更高及/或可能展示出有益的效果。此外，熟習該項技術者知道如何分離、濃化及/或選擇性地製備所述立體異構物。本發明的化合物可以存在為立體異構物的混合物、個別立體異構物或光學活性形式。值得注意者為阻轉異構物，其為一種在對於一單鍵之旋轉受到限制時所產生的分子立體異構構形，而使其相互轉化慢到得以分離。一或多個鍵之阻轉為與該分子其他部分之立體交互作用的結果。在本發明中，當對於一單不對稱鍵之自由旋轉的能量障壁高到使分離異構物成為可能時，式 1 與式 1A 化合物即可展現阻轉異構性(atropisomerism)。阻轉異構性之存在係定義為異構物具有至少 1000 秒的半衰期，其能量障壁在 20°C 為至少約 22.3 kcal mol⁻¹ (Oki, *Topics in Stereochemistry*, 第 14 卷, John Wiley & Sons, Inc., 1983)。熟習該項技術者將明瞭，一個阻轉異構物當相對於其他阻轉異構物經濃化或當從其他阻轉異構物經分離出時，可能活性更高及/或可能展示出有益的效果。此外，熟習技藝人士知道如何分離、濃化及/或選擇性地製備所述阻轉異構物。對於阻轉異構物之進一步描述可發現於 March, *Advanced Organic Chemistry*,

101-102, 第 4 版, 1992; Oki, *Topics in Stereochemistry*, 第 14 卷, John Wiley & Sons, Inc., 1983 與 Gawronski 等人, *Chirality* **2002**, *14*, 689-702。此發明包括相較於在一式 1 或式 1A 阻轉異構物中之外消旋混合物為經濃化之化合物。亦包括者為式 1 或式 1A 化合物之基本上為純的阻轉異構物。

亦值得注意者為式 1 與式 1A 之鏡像異構物。例如, 兩種可能之式 1 鏡像異構物在下文中係描述為式 1' 與式 1'', 其中其掌性中心係以一星號(*)標示, 並且取代基 R^4 與 R^5 並不相同。



本文中所描繪的分子圖示係遵照用於描繪立體化學之標準協定。為了指出立體組態, 由圖示平面且朝向觀看者升起之鍵係以實心楔形代表, 其中該楔形之寬端係連接至該原子且由圖示平面朝向觀看者升起。在圖示平面下方延伸且遠離觀看者之鍵係以空心楔形代表, 其中該楔形之窄端係連接至該原子且進一步遠離觀看者。等寬線代表其方向相反於或中性相對於以實心或空心楔形的鍵; 等寬線亦描述分子或分子部分上之鍵且不意欲指定其具有特定立體組態。

本發明包含外消旋混合物，例如等量之式 1' 與 1'' 鏡像異構物。此外，本發明包括相較於一式 1 或 1A 鏡像異構物中之外消旋混合物經濃化的化合物。亦包括者為式 1 或式 1A 化合物之基本上為純的鏡像異構物，例如式 1' 與式 1''。

當經鏡像異構性地濃化時，一種鏡像異構物存在之量係大於另一種，並且濃化之程度可由一鏡像異構物過量(「ee」)表示法來定義，其係定義為 $(2x-1) \cdot 100\%$ ，其中 x 為混合物中主要鏡像異構物的莫耳分率（例如 ee 為 20% 對應於 60:40 的鏡像異構物比例）。

值得注意的本發明組成物為具有一異構物之至少 50%、或至少 75%、或至少 90%、或至少 94% 的鏡像異構物過量者。特別值得注意的是鏡像異構性上為純的實施例。

式 1 或式 1A 化合物可包含額外之掌性中心。例如，取代基如 R^{3a} 本身可含有掌性中心。

熟習該項技術者會瞭解到，因為化合物的鹽類與它們對應的非鹽形式在環境和生理條件下會處於平衡狀態，所以鹽類會分享非鹽形式的生物效用。因此式 1 與式 1A 化合物之廣泛各式鹽類係可用於防治由真菌類植物病原體造成之植物病害（即農業上合適）。式 1 與式 1A 化合物之鹽類包括與無機或有機酸之酸-加成鹽類，如氫溴酸、鹽酸、硝酸、磷酸、硫酸、醋酸、丁酸、反丁烯二酸、乳酸、順丁烯二酸、丙二酸、草酸、丙酸、水楊酸、酒石酸、4-甲苯磺酸或戊酸。

選自式 1 或式 1A、其立體異構物、其 *N*-氧化物及其鹽類之化合物，典型為以超過一種的形式存在，因此式 1 與式 1A 包括所有式 1 與式 1A 所代表的結晶質與非結晶質形式。非晶形包括像是蠟和膠的固體實施例，也包括像是溶液和熔體的液體實施例。晶形包括基本上代表單晶類型的實施例及代表多形體混合物的實施例（即不同的晶形）。用語「多形體」意指一可以結晶成不同晶形之化合物的特定晶形，這些形式的晶格內分子有不同的排列及/或構形。雖然多形體可以有同樣的化學組成，它們也可以在組成上因為共結晶水或其他分子的存在或不存在而不同，該共結晶水或其他分子可以弱或強地結合在晶格內。多形體可以在化學、物理和生物特性有所不同，像是晶體形狀、密度、硬度、顏色、化學穩定性、熔點、吸濕性、懸浮率、溶解速率和生物利用度。熟習該項技術者將瞭解，由式 1 或式 1A 所代表的化合物之一多形體相，較於由式 1 或式 1A 所代表之相同化合物的另一種多形體或多形體混合物，可顯示出有利效果（例如適於製備有用的配方、改善生物性表現）。可藉由熟習該項技術者已知的方法製備及分離由式 1 或式 1A 所代表之化合物的一特定多形體，該些方法包括如利用選定的溶劑及溫度進行結晶。

如發明內容中所述之本發明實施例包括以下所述。在下列實施例中，式 1 包括立體異構物、其 *N*-氧化物及其鹽類，並且提及一式 1 化合物時係包括發明內容中指定的取代基定義，除非在實施例中有進一步定義。

實施例 1.一種式 1 化合物，其中 Q^1 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 2.一種實施例 1 化合物，其中 Q^1 為一經 2 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 3.一種實施例 1 化合物，其中 Q^1 為一經 1 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 4.一種實施例 1 化合物，其中 Q^1 為一經 2 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 5.一種實施例 1 化合物，其中 Q^1 為一經 3 個選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 6.一種式 1 化合物或實施例 1 至 5 其中任一者，其中 Q^1 為一苯環，其經至少一個連接於一鄰位（相對於該 Q^1 環連接至式 1 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 6a.一種式 1 化合物或實施例 1 至 6 其中任一者，其中 Q^1 為一苯環，其經兩個連接於一鄰位與該對位（相對於該 Q^1 環連接至式 1 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 6b.一種式 1 化合物或實施例 1 至 6 其中任一者，其中 Q^1 為一苯環，其經兩個皆連接於鄰位（相對於該 Q^1 環連接至式 1 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 6c.一種式 1 化合物或實施例 1 至 6 其中任一者，其中 Q^1 為一苯環，其經三個連接於兩個鄰位與該對位（相對於該 Q^1 環連接至式 1 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 7. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 6c 其中任一者，其中 Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；或一吡啶環、咪啶環、吡啶環、嗒【口+井】(pyridazinyl)環、吡【口+井】(pyrazinyl)環或嘧啶環，各環係選擇性地經至多 3 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} 的取代基取代。

實施例 8. 一種實施例 7 化合物，其中 Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；或一吡啶環、咪啶環或吡啶環，各環係選擇性地經 1 至 3 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} 的取代基取代。

實施例 9. 一種實施例 8 化合物，其中 Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 9a. 一種實施例 9 化合物，其中 Q^2 為一經 2 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 9b. 一種實施例 9 化合物，其中 Q^2 為一經 1 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 9c. 一種實施例 9 化合物，其中 Q^2 為一經 2 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 9d. 一種實施例 9 化合物，其中 Q^2 為一經 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 9e. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 9 其中任一者，其中 Q^2 為一苯環，其經至少兩個連接於一鄰位與該對位（相對於該 Q^2 環連接至式 1 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 9f. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 9 其中任一者，其中 Q^2 為一苯環，其經兩個皆連接於鄰位（相對於該 Q^2 環連接至式 1 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 9g. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 9 其中任一者，其中 Q^2 為一苯環，其經三個連接於兩個鄰位與該對位（相對於該 Q^2 環連接至式 1 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 10. 一種實施例 8 化合物，其中 Q^2 為一選擇性地經至多 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的吡啶環。

實施例 11. 一種實施例 10 化合物，其中 Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的吡啶環。

實施例 12. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 11 其中任一者，其中當 Q^2 為一 6 員完全不飽和雜環（例如吡啶、嗒【口+井】、吡【口+井】或嘧啶），則 Q^2 係經至少一個連接至一鄰位（相對於該 Q^2 環連接至式 1 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 13. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 12 其中任一者，其中當 Q^1 與 Q^2 各為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環，則一個環係經 2 至 3 個取代基取代並且另一環係經 1 至 3 個取代基取代。

實施例 14. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 12 其中任一者，其中當 Q^1 與 Q^2 各為一經 1 至 3 個獨立

選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環，則一個環係經 2 至 3 個取代基取代並且另一環係經 1 至 2 個取代基取代。

實施例 14a. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 12 其中任一者，其中當 Q^1 與 Q^2 各為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環，則一個環係經 3 個取代基取代並且另一環係經 2 個取代基取代。

實施例 14b. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 12 其中任一者，其中 Q^1 與 Q^2 皆為一經 2 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 15. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 14b 其中任一者，其中 R^1 為 C_1 - C_2 烷基、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CH}_2\text{Cl}$ 或環丙基。

實施例 16. 一種實施例 15 化合物，其中 R^1 為甲基、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 或 $-\text{CH}_2\text{Cl}$ 。

實施例 17. 一種實施例 16 化合物，其中 R^1 為甲基。

實施例 18. 一種式 1 化合物或實施例 1 至 17 其中任一者，其中 R^2 為 H、鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_2 - C_4 烯基、鹵甲基、氰甲基、羥甲基、 C_2 - C_3 烷氧烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基。

實施例 18a. 一種實施例 18 化合物，其中 R^2 為鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、鹵甲基、氰甲基、羥甲基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基。

實施例 18b.一種實施例 18a 化合物，其中 R^2 為鹵素、
氰基、 C_1 - C_2 烷基、鹵甲基、氰甲基、羥甲基或
甲氧基。

實施例 19.一種實施例 18b 化合物，其中 R^2 為鹵素、
氰基、甲基、鹵甲基或甲氧基。

實施例 20.一種實施例 19 化合物，其中 R^2 為 Br、Cl、
F、氰基、甲基或甲氧基。

實施例 20a.一種實施例 20 化合物，其中 R^2 為 Br、
Cl、甲基或甲氧基。

實施例 21.一種實施例 20a 化合物，其中 R^2 為甲基。

實施例 22.一種式 1 化合物或實施例 1 至 21 其中任
一者，其中各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷
基、 C_1 - C_2 鹵烷基、環丙基、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2
烷硫基、 C_2 - C_3 烷羰基或 -U-V-T。

實施例 23.一種實施例 22 化合物，其中各 R^{3a} 獨立為
鹵素、氰基、甲基、鹵甲基、環丙基、甲氧基、
甲硫基、甲羰基或 -U-V-T。

實施例 24.一種實施例 23 化合物，其中各 R^{3a} 獨立為
鹵素、氰基、甲基、鹵甲基或甲氧基。

實施例 25.一種實施例 24 化合物，其中各 R^{3a} 獨立為
鹵素、氰基或甲氧基。

實施例 26.一種實施例 25 化合物，其中各 R^{3a} 獨立為
Br、Cl、F、氰基或甲氧基。

實施例 27.一種實施例 26 化合物，其中各 R^{3a} 獨立為
Cl 或 F。

實施例 28.一種式 1 化合物或實施例 1 至 27 其中任一者，其中各 U 獨立為 O、N(R¹⁰)或一直接鍵。

實施例 29.一種實施例 28 化合物，其中各 R¹⁰ 獨立為 H 或甲基。

實施例 30.一種實施例 28 化合物，其中各 U 獨立為 O、NH 或一直接鍵。

實施例 31.一種式 1 化合物或實施例 1 至 30 其中任一者，其中各 V 獨立為 C₁-C₄ 伸烷基，其中至多 1 個碳原子係選自 C(=O)。

實施例 32.一種實施例 31 化合物，其中各 V 獨立為 C₁-C₃ 伸烷基。

實施例 33.一種式 1 化合物或實施例 1 至 32 其中任一者，其中各 T 獨立為 N(R^{11a})(R^{11b})或 OR¹²。

實施例 34.一種式 1 化合物或實施例 1 至 33 其中任一者，其中各 R^{11a} 與 R^{11b} 獨立為 H、C₁-C₆ 烷基或 C₁-C₆ 鹵烷基。

實施例 35.一種實施例 34 化合物，其中各 R^{11a} 與 R^{11b} 獨立為 H 或甲基。

實施例 36.一種式 1 化合物或實施例 1 至 35 其中任一者，其中各 R¹² 獨立為 H、C₁-C₆ 烷基或 C₁-C₆ 鹵烷基。

實施例 37.一種實施例 36 化合物，其中各 R¹² 獨立為 H、甲基或鹵甲基。

實施例 38.一種式 1 化合物或實施例 1 至 37 其中任一者，其中各 R^{3b} 獨立為氰基、C₁-C₂ 烷基、環丙基或 C₂-C₃ 烷氧烷基。

- 實施例 39.一種實施例 38 化合物，其中各 R^{3b} 為甲基。
- 實施例 40.一種式 1 化合物或實施例 1 至 39 其中任一者，其中 R^4 為鹵素或 $-\text{SC}\equiv\text{N}$ 。
- 實施例 41.一種實施例 40 化合物，其中 R^4 為 $-\text{SC}\equiv\text{N}$ 。
- 實施例 42.一種實施例 40 化合物，其中 R^4 為鹵素。
- 實施例 43.一種實施例 42 化合物，其中 R^4 為 Br、Cl 或 F。
- 實施例 44.一種式 1 化合物或實施例 1 至 39 其中任一者，其中 R^4 為 $-\text{OR}^7$ 。
- 實施例 45.一種式 1 化合物或實施例 1 至 44 其中任一者，其中 R^4 為 Br、Cl、F、 $-\text{OR}^7$ 或 $-\text{SC}\equiv\text{N}$ 。
- 實施例 46.一種實施例 45 化合物，其中 R^4 為 Br、Cl、F 或 $-\text{OR}^7$ 。
- 實施例 47.一種式 1 化合物或實施例 1 至 46 其中任一者，其中 R^5 為 H 或甲基。
- 實施例 48.一種實施例 47 化合物，其中 R^5 為 H。
- 實施例 49.一種式 1 化合物或實施例 1 至 48 其中任一者，其中 R^7 為 H、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ 烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 烯基、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ 鹵烷基、環丙基、 $\text{C}_2\text{-C}_3$ 氰烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ 烷氧烷基、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{OM}^1$ 或 $-\text{C}(=\text{W})\text{R}^9$ 。
- 實施例 50.一種實施例 49 化合物，其中 R^7 為 H、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ 鹵烷基、環丙基、 $\text{C}_2\text{-C}_3$ 氰烷基、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{OM}^1$ 或 $-\text{C}(=\text{W})\text{R}^9$ 。
- 實施例 51.一種實施例 50 化合物，其中 R^7 為 H、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ 鹵烷基、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{OM}^1$ 或 $-\text{C}(=\text{W})\text{R}^9$ 。

實施例 52.一種實施例 51 化合物，其中 R^7 為 H、甲基或 $-C(=W)R^9$ 。

實施例 53.一種實施例 52 化合物，其中 R^7 為 H 或甲基。

實施例 54.一種實施例 53 化合物，其中 R^7 為 H。

實施例 55.一種式 1 化合物或實施例 1 至 54 其中任一者，其中 R^9 為甲基或甲氧基。

實施例 56 一種實施例 55 化合物，其中 R^9 為甲基。

實施例 57.一種式 1 化合物或實施例 1 至 56 其中任一者，其中 W 為 O。

實施例 58.一種式 1 化合物或實施例 1 至 57 其中任一者，其中 M^1 為 Na 或 K。

實施例 59.一種實施例 58 化合物，其中 M^1 為 Na。

本發明之實施例（包括以上實施例 1 至 59 以及任何其他本文中所述之實施例）可以任何方式組合，並且實施例中之變數描述不只適用於式 1 化合物，亦適用於可用於製備該式 1 化合物之起始化合物與中間物化合物。此外，本發明的實施例（包括上述實施例 1 至 59 以及任何其他本文中所述之實施例，以及任何其組合），均適用於本發明之組成物與方法。

實施例 1 至 59 之組合物係藉由以下闡述：

實施例 A.式 1 之化合物，其中

Q^1 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；

Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；或一吡唑環、咪唑環、吡啶

環、嗒【口+井】環、吡【口+井】環或嘍啉環，各環係選擇性地經至多 3 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} 的取代基取代；

R^1 為 C_1 - C_2 烷基、 $-\text{CH}_2\text{F}$ 、 $-\text{CH}_2\text{Cl}$ 或環丙基；

R^2 為 H、鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_2 - C_4 烯基、鹵甲基、氰甲基、羥甲基、 C_2 - C_3 烷氧烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、環丙基、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 烷硫基、 C_2 - C_3 烷羰基或 -U-V-T；

各 R^{3b} 獨立為氰基、 C_1 - C_2 烷基、環丙基或 C_2 - C_3 烷氧烷基；

R^4 為 Br、Cl、F、 $-\text{OR}^7$ 或 $-\text{SC}\equiv\text{N}$ ；

R^5 為 H 或甲基；

R^7 為 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_1 - C_3 鹵烷基、環丙基、 C_2 - C_3 氰烷基、 C_2 - C_6 烷氧烷基、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{OM}^1$ 或 $-\text{C}(=\text{W})\text{R}^9$ ；

R^9 為甲基或甲氧基；

各 U 獨立為 O、 $\text{N}(\text{R}^{10})$ 或一直接鍵；

各 R^{10} 獨立為 H 或甲基；

各 V 獨立為 C_1 - C_3 伸烷基，其中至多 1 個碳原子係選自 $\text{C}(=\text{O})$ ；

各 T 獨立為 $\text{N}(\text{R}^{11a})(\text{R}^{11b})$ 或 OR^{12} ；

各 R^{11a} 與 R^{11b} 獨立為 H 或甲基；

各 R^{12} 獨立為 H、 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 鹵烷基；
 W 為 O；以及
 M^1 為 Na 或 K。

實施例 B. 實施例 A 化合物，其中

Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；或一吡唑環、咪唑環或吡啶環，各環係選擇性地經 1 至 3 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} 的取代基取代；

R^1 為甲基、 $-CH_2F$ 或 $-CH_2Cl$ ；

R^2 為鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、鹵甲基、氰甲基、羥甲基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、甲基、鹵甲基、環丙基、甲氧基、甲硫基、甲羰基或 $-U-V-T$ ；

各 R^{3b} 為甲基；

R^4 為 Br、Cl、F 或 $-OR^7$ ；

R^7 為 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 $-S(=O)_2OM^1$ 或 $-C(=W)R^9$ ；

各 U 獨立為 O、NH 或一直接鍵；

各 V 為 C_1 - C_3 伸烷基；與

各 R^{12} 獨立為 H、甲基或鹵甲基。

實施例 C. 一種實施例 B 化合物，其中

Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；

R^1 為甲基；

R^2 為鹵素、氰基、甲基、鹵甲基或甲氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、甲基、鹵甲基或甲氧基；

R^4 為 $-OR^7$ ；

R^5 為 H；

R^7 為 H、甲基或 $-C(=W)R^9$ ；以及

R^9 為甲基。

實施例 D. 一種實施例 C 化合物，其中

R^2 為 Br、Cl、甲基或甲氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基或甲氧基；以及

R^7 為 H。

實施例 E. 一種實施例 D 化合物，其中

R^2 為甲基；

各 R^{3a} 獨立為 Br、Cl、F、氰基或甲氧基；

以及

Q^1 與 Q^2 其中一者係經 2 至 3 個取代基取代
並且 Q^1 與 Q^2 中之另一者係經 1 至 2 個
取代基取代。

特定實施例包括選自由以下所組成之群組的式 1
化合物：

α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二
甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

(αS)- α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2-氯-6-氟苯
基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

(αR)- α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇;

α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2,6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇;

(αS)- α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇;

(αR)- α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2,6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇;

α ,5-雙(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇;

5-(2-溴苯基)- α -(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇;

α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2,6-二氯苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇;

α -(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-5-(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-4-甲醇;

α -(2-溴-4-氟苯基)-5-(2,6-二氯苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇;

α -(2-溴-4-氟苯基)-5-(2-氯-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇;

3-溴-5-(2-氯-4-氟苯基)- α -(2,4-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇;

5-(2-氯-4-氟苯基)- α -(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇;

5-(2,4-二氯苯基)- α -(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇;

5-(2-氯-6-氟苯基)- α -(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

α -(2,4-二氟苯基)-5-(2,6-二氯苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

4-[4-[(2,4-二氟苯基)羧甲基]-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]-3,5-二氟苯甲腈；

5-(2-氯-6-氟苯基)- α -(2,4-二氯苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2-氯-6-氟苯基)- α -(2,6-二氯苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基- α -(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2-溴-4-氟苯基)-1,3-二甲基- α -(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2-氯-6-氟苯基)- α -(2-氯-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

3-溴- α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

3-氯- α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2-氯-6-氟苯基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2,6-二氟苯基)- α -(4-氟-2-甲基苯基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

α -(2-氯-4-甲氧基)-5-(2,6-二氟苯基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；
 5-(2,6-二氟苯基)-3-甲氧基- α -(4-甲氧基-2-甲基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；
 5-(2-氯-6-氟苯基)- α -(2-氯-4-甲氧基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；
 3-氯-5-(2,6-二氟苯基)- α -(4-甲氧基-2-甲基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；
 3-氯-5-(2,6-二氟苯基)- α -(2-氯-4-甲氧基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；
 3-氯- α -(2-氯-4-甲氧基)-5-(2,6-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；以及
 3-溴-5-(2,6-二氟苯基)- α -(4-甲氧基-2-甲基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇。

如本發明內容所提及者，此發明亦涉及一式 1A 化合物。式 1A 實施例包括發明內容中所述者以及下列實施例。在下列實施例中，式 1A 包括立體異構物、其 *N*-氧化物及其鹽類，並且提及「一式 1A 化合物」時係包括發明內容中指定的取代基定義，除非在實施例中有進一步定義。

實施例 A1. 一種式 1A 化合物，其中 Q^1 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 A2. 一種實施例 A1 化合物，其中 Q^1 為一經 2 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 A3. 一種實施例 A1 化合物，其中 Q^1 為一經 1 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 A4.一種實施例 A1 化合物，其中 Q^1 為一經 2 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 A5.一種實施例 A1 化合物，其中 Q^1 為一經 3 個選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 A6.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A5 其中任一者，其中 Q^1 為一苯環，其經至少一個連接於一鄰位（相對於該 Q^1 環連接至式 1A 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 A7.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A6 其中任一者，其中 Q^1 為一苯環，其經兩個連接於一鄰位與該對位（相對於該 Q^1 環連接至式 1A 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 A8.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A6 其中任一者，其中 Q^1 為一苯環，其經兩個皆連接於鄰位（相對於該 Q^1 環連接至式 1A 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 A9.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A6 其中任一者，其中 Q^1 為一苯環，其經三個連接於兩鄰位與該對位（相對於該 Q^1 環連接至式 1A 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 A10.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A9 其中任一者，其中 Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；或一吡唑環、咪唑環、吡啶環、嗒【口+井】環、吡【口+井】環或嘧啶環，各環係選擇性地經至多 3 個獨立選

自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} 的取代基取代。

實施例 A11. 一種實施例 A10 化合物，其中 Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；或一吡啶環、咪唑環或吡啶環，各環係選擇性地經 1 至 3 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} 的取代基取代。

實施例 A12. 一種實施例 A11 化合物，其中 Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 A13. 一種實施例 A12 化合物，其中 Q^2 為一經 2 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 A14. 一種實施例 A13 化合物，其中 Q^2 為一經 1 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 A15. 一種實施例 A13 化合物，其中 Q^2 為一經 2 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 A16. 一種實施例 A13 化合物，其中 Q^2 為一經 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 A17. 一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A16 其中任一者，其中 Q^2 為一苯環，其經兩個連接於一鄰位與該對位（相對於該 Q^2 環連接至式 1A 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 A18. 一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A17 其中任一者，其中 Q^2 為一苯環，其經兩個皆連接於鄰位（相對於該 Q^2 環連接至式 1A 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 A19.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A18 其中任一者，其中 Q^2 為一苯環，其經三個連接於兩鄰位與該對位（相對於該 Q^2 環連接至式 1A 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 A20.一種實施例 A11 化合物，其中 Q^2 為一選擇性地經至多 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的吡啶環。

實施例 A21.一種實施例 A20 化合物，其中 Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的吡啶環。

實施例 A22.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A21 其中任一者，其中當 Q^2 為一 6 員完全不飽和雜環（例如吡啶、嗒【口+井】、吡【口+井】或嘧啶），則 Q^2 係經至少一個連接至一鄰位（相對於該 Q^2 環連接至式 1A 其餘部分之連接處）之 R^{3a} 取代基取代。

實施例 A23.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A22 其中任一者，其中當 Q^1 與 Q^2 各為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環，則一個環係經 2 至 3 個取代基取代並且另一環係經 1 至 3 個取代基取代。

實施例 A24.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A23 其中任一者，其中當 Q^1 與 Q^2 各為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環，則一個環係經 2 至 3 個取代基取代並且另一環係經 1 至 2 個取代基取代。

實施例 A25.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A24 其中任一者，其中當 Q^1 與 Q^2 各為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環，則一個環係經 3 個取代基取代並且另一環係經 2 個取代基取代。

實施例 A26.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A25 其中任一者，其中 Q^1 與 Q^2 皆為一經 2 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環。

實施例 A27.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A26 其中任一者，其中 X 為 O、S、 $N(R^6)$ 或 $C(=O)$ 。

實施例 A28.一種實施例 A27 化合物，其中 X 為 O、NH 或 $C(=O)$ 。

實施例 A29.一種實施例 A27 化合物，其中 X 為 $N(R^6)$ 。

實施例 A29a.一種實施例 A29 化合物，其中 X 為 NH。

實施例 A30.一種實施例 A28 化合物，其中 X 為 O。

實施例 A31.一種實施例 A28 化合物，其中 X 為 $C(=O)$ 。

實施例 A32.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A31 其中任一者，其中 R^1 為 C_1 - C_2 烷基、 $-CH_2F$ 、 $-CH_2Cl$ 或環丙基。

實施例 A33.一種實施例 A32 化合物，其中 R^1 為甲基、 $-CH_2F$ 或 $-CH_2Cl$ 。

實施例 A34.一種實施例 A33 化合物，其中 R^1 為甲基。

實施例 A35.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A34 其中任一者，其中 R^2 為 H、鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_2 - C_4 烯基、鹵甲基、氰甲基、羥甲基、 C_2 - C_3 烷氧烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基。

實施例 A36.一種實施例 A35 化合物，其中 R^2 為鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、鹵甲基、氰甲基、羥甲基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基。

實施例 A37.一種實施例 A36 化合物，其中 R^2 為鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、鹵甲基、氰甲基、羥甲基或甲氧基。

實施例 A38.一種實施例 A37 化合物，其中 R^2 為鹵素、氰基、甲基、鹵甲基或甲氧基。

實施例 A39.一種實施例 A38 化合物，其中 R^2 為 Br、Cl、F、氰基、甲基或甲氧基。

實施例 A40.一種實施例 A39 化合物，其中 R^2 為 Br、Cl、甲基或甲氧基。

實施例 A41.一種實施例 A40 化合物，其中 R^2 為甲基。

實施例 A42.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A41 其中任一者，其中各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、環丙基、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 烷硫基、 C_2 - C_3 烷羰基或 -U-V-T。

實施例 A43.一種實施例 A42 化合物，其中各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、甲基、鹵甲基、環丙基、甲氧基、甲硫基、甲羰基或 -U-V-T。

實施例 A44.一種實施例 A43 化合物，其中各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、甲基、鹵甲基或甲氧基。

實施例 A45.一種實施例 A44 化合物，其中各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基或甲氧基。

實施例 A46.一種實施例 A45 化合物，其中各 R^{3a} 獨立為 Br、Cl、F、氰基或甲氧基。

實施例 A47.一種實施例 A46 化合物，其中各 R^{3a} 獨立為 Cl 或 F。

實施例 A48.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A47 其中任一者，其中各 U 獨立為 O、 $N(R^{10})$ 或一直接鍵。

實施例 A49.一種實施例 A48 化合物，其中各 R^{10} 獨立為 H 或甲基。

實施例 A50.一種實施例 A48 化合物，其中各 U 獨立為 O、NH 或一直接鍵。

實施例 A51.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A50 其中任一者，其中各 V 獨立為 C_1 - C_4 伸烷基，其中至多 1 個碳原子係選自 $C(=O)$ 。

實施例 A52.一種實施例 A51 化合物，其中各 V 獨立為 C_1 - C_3 伸烷基。

實施例 A53.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A52 其中任一者，其中各 T 獨立為 $N(R^{11a})(R^{11b})$ 或 OR^{12} 。

實施例 A54.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A53 其中任一者，其中各 R^{11a} 與 R^{11b} 獨立為 H、 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 鹵烷基。

實施例 A55.一種實施例 A54 化合物，其中各 R^{11a} 與 R^{11b} 獨立為 H 或甲基。

實施例 A56.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A55 其中任一者，其中各 R^{12} 獨立為 H、 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 鹵烷基。

實施例 A57.一種實施例 A56 化合物，其中各 R^{12} 獨立為 H、甲基或鹵甲基。

實施例 A58.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A57 其中任一者，其中各 R^{3b} 獨立為氰基、 C_1 - C_2 烷基、環丙基或 C_2 - C_3 烷氧烷基。

實施例 A59.一種實施例 A58 化合物，其中各 R^{3b} 為甲基。

實施例 A60.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A59 其中任一者，其中 R^6 為 H、羥基、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_2 - C_3 烷氧烷基、 $-\text{CH}(=\text{O})$ 、 $-\text{OR}^7$ 、 $-\text{OS}(=\text{O})_2\text{M}^1$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_n\text{R}^8$ 或 $-\text{C}(=\text{W})\text{R}^9$ 。

實施例 A61.一種實施例 A60 化合物，其中 R^6 為 H、甲基、鹵甲基或 $-\text{OR}^7$ 。

實施例 A62.一種實施例 A61 化合物，其中 R^6 為 H。

實施例 A63.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A62 其中任一者，其中 R^7 為 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_1 - C_3 鹵烷基、環丙基、 C_2 - C_3 氰烷基、 C_2 - C_6 烷氧烷基、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{OM}^1$ 或 $-\text{C}(=\text{W})\text{R}^9$ 。

實施例 A64.一種實施例 A63 化合物，其中 R^7 為 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、環丙基、 C_2 - C_3 氰烷基、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{OM}^1$ 或 $-\text{C}(=\text{W})\text{R}^9$ 。

實施例 A65.一種實施例 A64 化合物，其中 R^7 為 H、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 $-S(=O)_2OM^1$ 或 $-C(=W)R^9$ 。

實施例 A66.一種實施例 A65 化合物，其中 R^7 為 H、甲基或 $-C(=W)R^9$ 。

實施例 A67.一種實施例 A66 化合物，其中 R^7 為 H 或甲基。

實施例 A68.一種實施例 A67 化合物，其中 R^7 為 H。

實施例 A69.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A68 其中任一者，其中 R^8 為甲基。

實施例 A70.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A69 其中任一者，其中 R^9 為甲基或甲氧基。

實施例 A71.一種實施例 A70 化合物，其中 R^9 為甲基。

實施例 A72.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A72 其中任一者，其中 W 為 O。

實施例 A73.一種式 1A 化合物或實施例 A1 至 A72 其中任一者，其中 M^1 為 Na 或 K。

實施例 A74.一種實施例 A73 化合物，其中 M^1 為 Na。

本發明之實施例（包括以上實施例 A1 至 A74 以及任何其他本文中所述之實施例）可以任何方式組合，並且實施例中之變數描述不只適用於式 1A 化合物，亦適用於可用於製備該式 1A 化合物之起始化合物與中間物化合物。此外，本發明的實施例（包括上述實施例 A1 至 A74 以及任何其他本文中所述之實施例，以及任何其組合），均適用於本發明之組成物與方法。

實施例 A1 至 A74 之組合物係藉由以下說明：

實施例 F. 式 1A 化合物，其中

Q^1 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；

Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；或一吡啶環、咪唑環、吡啶環、嗒【口+井】環、吡【口+井】環或嘧啶環，各環係選擇性地經至多 3 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} 的取代基取代；

X 為 O、S、N(R^6) 或 C(=O)；

R^1 為 C_1 - C_2 烷基、 $-CH_2F$ 、 $-CH_2Cl$ 或環丙基；

R^2 為 H、鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_2 - C_4 烯基、鹵甲基、氰甲基、羥甲基、 C_2 - C_3 烷氧烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、環丙基、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 烷硫基、 C_2 - C_3 烷羰基或 -U-V-T；

各 R^{3b} 獨立為氰基、 C_1 - C_2 烷基、環丙基或 C_2 - C_3 烷氧烷基；

R^6 為 H、羥基、 $-CH(=O)$ 、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_2 - C_3 烷氧烷基、 $-OR^7$ 、 $-S(=O)_2OM^1$ 、 $-S(=O)_nR^8$ 或 $-C(=W)R^9$ ；

R^7 為 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_1 - C_3 鹵烷基、環丙基、 C_2 - C_3 氰烷基、 C_2 - C_6 烷氧烷基、 $-S(=O)_2OM^1$ 或 $-C(=W)R^9$ ；

R^8 為甲基；

R^9 為甲基或甲氧基；

各 U 獨立為 O、 $N(R^{10})$ 或一直接鍵；

各 R^{10} 獨立為 H 或甲基；

各 V 獨立為 C_1 - C_3 伸烷基，其中至多 1 個碳原子係選自 $C(=O)$ ；

各 T 獨立為 $N(R^{11a})(R^{11b})$ 或 OR^{12} ；

各 R^{11a} 與 R^{11b} 獨立為 H 或甲基；

各 R^{12} 獨立為 H、 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 鹵烷基；

W 為 O；以及

M^1 為 Na 或 K。

實施例 G. 一種實施例 F 化合物，其中

Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；或一吡啶環、咪唑環或吡啶環，各環係選擇性地經 1 至 3 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} 的取代基取代；

R^1 為甲基、 $-CH_2F$ 或 $-CH_2Cl$ ；

R^2 為鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、鹵甲基、氰甲基、羥甲基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、甲基、鹵甲基、
環丙基、甲氧基、甲硫基、甲羰基或
-U-V-T；

各 R^{3b} 為甲基；

R^6 為 H、甲基、鹵甲基或 $-OR^7$ ；

R^7 為 H、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、
 $-S(=O)_2OM^1$ 或 $-C(=W)R^9$ ；

各 U 獨立為 O、NH 或一直接鍵；

各 V 為 C_1-C_3 伸烷基；與

各 R^{12} 獨立為 H、甲基或鹵甲基。

實施例 H. 一種實施例 G 化合物，其中

Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；

R^1 為甲基；

R^2 為鹵素、氰基、甲基、鹵甲基或甲氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、甲基、鹵甲基或
甲氧基；

R^7 為 H、甲基或 $-C(=W)R^9$ ；以及

R^9 為甲基。

實施例 I. 實施例 H 化合物，其中

X 為 O、S、NH 或 $C(=O)$ ；

R^2 為 Br、Cl、甲基或甲氧基；以及

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基或甲氧基。

實施例 J. 實施例 I 化合物，其中

R^2 為甲基；

各 R^{3a} 獨立為 Br、Cl、F、氟基或甲氧基；
以及

Q^1 與 Q^2 其中一者係經 2 至 3 個取代基取代
並且 Q^1 與 Q^2 中之另一者係經 1 至 2 個
取代基取代。

特定實施例包括選自由以下所組成之群組的式 1A
化合物：

5-(2-氯-4-甲氧苯基)-4-(2,4-二氟苯氧基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑；

4-(2-氯-4-氟苯氧基)-5-(2-氯-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑；

3-氯-4-[4-(2-氯-4-氟苯氧基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]苯甲腈；

4-[[5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基]胺基]-3,5-二氟苯甲腈；

N,5-雙(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-胺；

3-氯-4-[[5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基]氧基]苯甲腈；

5-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(2,4-二氯苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-胺；

5-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(4-氯-2-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-胺；

4-(2-氯-4-氟苯甲醯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-3-腈；

N-(2-溴-4-氟苯基)-5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-胺；

N-(2,4-二氯苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-胺；以及

[5-(2,4-二氯苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基](2,4-二氟苯基)甲酮。

值得注意為式 1 與式 1A 化合物（包括所有立體異構物）、其 *N*-氧化物及其鹽類（包括但不限於以上實施例 1 至 59 與 A1 至 A74）為其中 R^2 為鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、鹵甲基、氰甲基、羥甲基、環丙基、鹵環丙基、甲硫基或甲氧基者。

值得進一步注意的式 1 與式 1A 化合物（包括所有立體異構物）、其 *N*-氧化物及其鹽類（包括但不限於以上實施例 1 至 59 與 A1 至 A74）為其中 R^7 為 H、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_3 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_2 - C_6 氰烷基、 $-\text{CH}(=\text{O})$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{OM}^1$ 或 $-\text{C}(=\text{W})\text{R}^9$ 者。

值得注意的為式 1（包括所有立體異構物）、其 *N*-氧化物及其鹽類（包括但不限於以上實施例 1 至 59）為其中 R^4 為鹵素、 $-\text{OR}^7$ 者。

本發明提供一種殺真菌組成物，其包含一式 1 或式 1A 化合物（包括所有立體異構物、其 *N*-氧化物及其鹽類）以及至少一種其他殺真菌劑。值得注意的是此類組合物之實施例係包含一對應於任何上述化合物實施例之化合物。

本發明提供一種殺真菌組成物，其包含一式 1 或式 1A 化合物（包括所有立體異構物、其 *N*-氧化物及其鹽類）（即以一殺真菌有效量），以及至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑與液體稀釋劑所組成之群組的額外組分。值得注意的是此類組合物之實施例係包含一對應於任何上述化合物實施例之化合物。

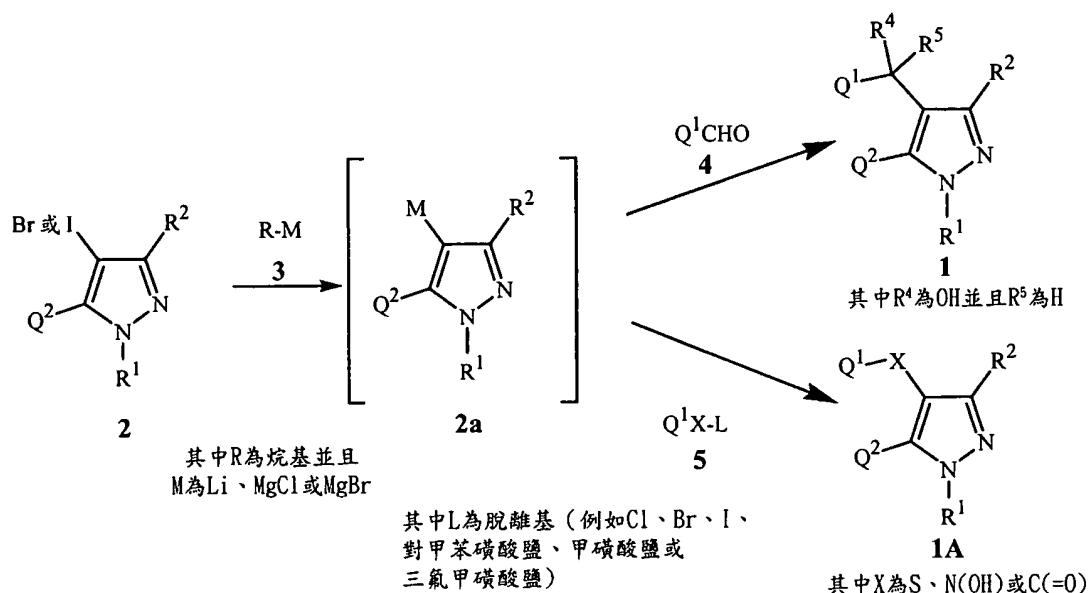
本發明提供一種用於防治由真菌類植物病原體造成之植物病害的方法，其包含施予該植物或其部分或該植物種子一殺真菌有效量之一式 1 或式 1A 化合物（包括所有立體異構物、其 *N*-氧化物及其鹽類）。值得注意的是此類方法之實施例係包含施予一殺真菌有效量之一對應於任何上述化合物實施例之化合物。特別值得注意的實施例係以本發明之組合物來施予該化合物。

如以下流程 1 至 9 所述之一或多種方法或其變化型可用於製備式 1 化合物與式 1A 化合物。在以下式 1 至 17 中， Q^1 、 Q^2 、 R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 與 X 的定義係如同定義於以上發明內容中者，除非另有指明。

某些式 1 與式 1A 化合物可如流程 1 所示者製備。在此方法中，一式 2 化合物係先以一式 3 有機金屬劑如烷基鋰鹼（例如正丁基鋰、二級丁基鋰或二異丙基醯胺鋰）或一格任亞試劑(Grignard reagent)在一溶劑如甲苯、乙醚、四氫呋喃或二甲氧基甲烷中在約 -78°C 至環境溫度之溫度範圍處理。使式 2a 陰離子（即即位產生之式 2 金屬化中間物）之後與一式 4 或 5 親電子劑接觸。一合適式 4 或 5 之親電子劑之使用與選擇會取決於所欲之式 1 或式 1A 化合物並且對於熟習化學合成者為

顯而易見。例如，式 Q^1CHO 之醛提供式 **1** 化合物（其中 R^4 為 OH 且 R^5 為 H 者）；式 $Q^1C(=O)Cl$ 之苯甲醯氯或式 $Q^1C(=O)N(Me)OMe$ 之苯甲醯胺提供式 **1A** 化合物（其中 X 為 $C(=O)$ 者），式 Q^1SCl 之氯硫化物或式 Q^1S-S-Q^1 之二硫化物提供式 **1A** 化合物（其中 X 為 S 者），以及式 $Q^1N(=O)$ 之亞硝基提供式 **1A** 化合物（其中 X 為 $N(OH)$ 者）。在親電子劑為 $Q^1C(O)Cl$ 的情況下，在加入該親電子劑前加入第二有機金屬劑如氯化鋅、溴化鋅或一單價銅鹽如碘化銅(I)或氰化銅(I)會增進反應性。在關於金屬化/烷化反應之合成文獻中已描述廣泛各式通用方法，其可迅速應用於製備本發明之化合物。在本揭露中，實例 4 步驟 D、實例 6 與實例 9 步驟 E 說明流程 1 之方法。

流程 1



式 4 與 5 之親電子劑係市售可得且可以該技術領域中已知的方法製備。式 2 化合物為習知且可用以下流程 3 中所揭露之方法製備，並且可以化學文獻中揭露的各式方法製備。

如流程 2 所示，式 1a 化合物（即其中 R^4 為 OH 且 R^5 為 H 之式 1）可使用標準還原技術來還原以提供式 1Aa 酮化合物（即其中 X 為 C(=O) 之式 1A）。典型反應條件涉及使一硼基還原劑如硼氫化鈉或三乙醯氧基硼氫化鈉與式 1Aa 化合物在一溶劑如低碳醇類或四氫呋喃中接觸。亦可使用其他熟習該項技術者習知的技術。關於相關參考文獻，請參見如 *Organic Letters* 2009, 11, 1659-1662, *Journal of the American Chemical Society* 2006, 128, 9998-9999, 以及 *Acta Chemica Scandinavica* 1991, 45, 925-929。並且，實例 8 與 11 說明式 1a 化合物由式 1Aa 之對應酮的製備。

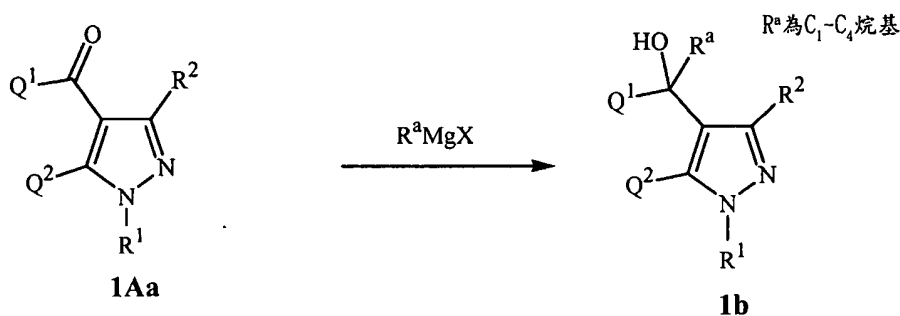
流程 2



如流程 3 所示，式 1Aa 之酮化合物（即其中 X 為 C(=O) 之式 1A）亦可以烷基鎂鹵化物處理以提供式 1b 化合物（即其中 R^4 為 OH 且 R^5 為 C₁-C₄ 烷基之式 1）。

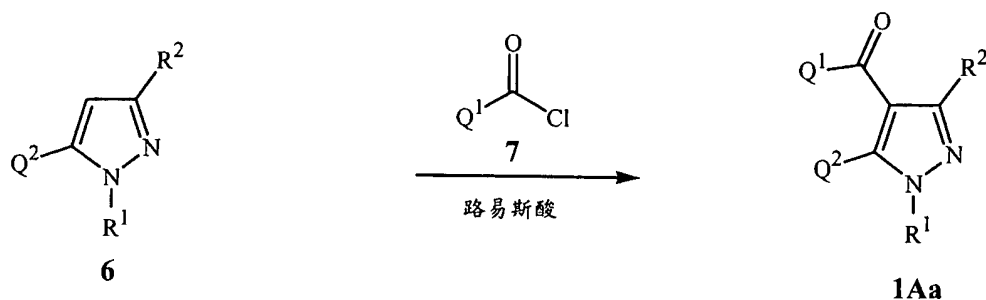
典型的是，該反應於氯化鋅存在下並在溶劑如二乙醚或四氫呋喃中且在約 0 至 100°C 的溫度進行（參考文獻請參見如 *Organic Lett.* **2009**, *11*, 1659-1662, *J. Am. Chem. Soc.* **2006**, *128*, 9998-9999 以及 *Acta Chemica Scandinavica* **1991**, *45*, 925-929）。

流程 3



在流程 1 方法之一替代方法中，式 1Aa 之吡唑（即其中 X 為 C(=O) 之式 1A）可使用夫里德耳-夸夫特醯化 (Friedel-Crafts acylation) 條件製備自式 6 化合物，如流程 4 中所說明者。在此方法中，式 6 化合物係與一式 7 醯氯於路易斯酸（例如氯化鋁、三氟化硼二乙基乙醚合物或四氯化錫）存在下在溶劑如二氯甲烷、四氯乙烷或胺基苯中在約 0 至 200°C 間的溫度範圍接觸。本實例 7 與實例 10 步驟 C 說明流程 4 方法。

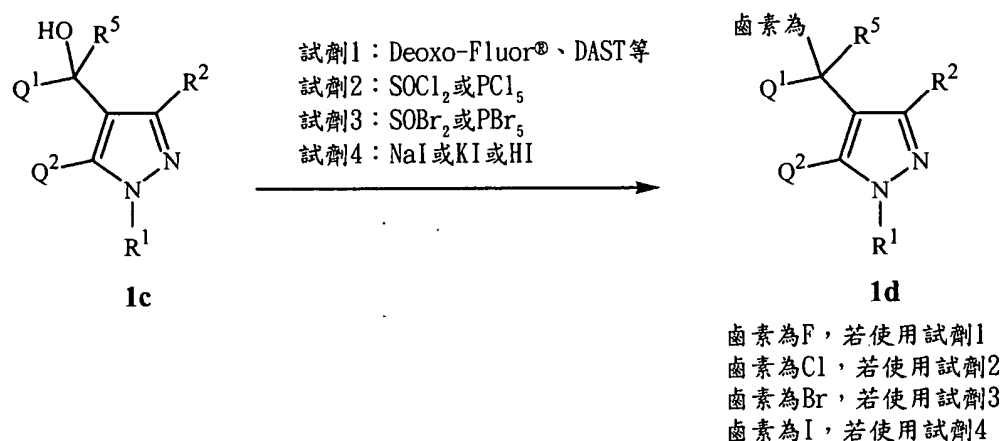
流程 4



如流程 5 所示，式 **1c** 化合物（即其中 R^4 為 OH 之式 **1**）可使用發表於化學文獻中之各式條件轉化為式 **1d** 化合物（即其中 R^4 為鹵素之式 **1**）。例如，以一氟化劑（例如雙(2-甲氧乙基)胺基硫(Deoxo-Fluor®)、三氟化二乙胺硫(DAST)、HF-吡啶（歐拉試劑(Olah's reagent)）或四氟化硫）處理一式 **1c** 化合物，以提供其中 R^4 為 F 之式 **1d** 化合物。關於反應條件，請參見 C. J. Wang, *Organic Reactions* **2005**, Vol. 34 (Wiley, New York, 1951) 第 2 章，第 319-321 頁；並且，本實例 5 說明其中 R^4 為 F 且 R^5 為 H 之一式 **1d** 化合物的製備。其中 R^4 為 Br 之式 **1d** 化合物可藉由以氫溴酸在溶劑如冰醋酸中處理對應之式 **1c** 化合物而製備，此係使用 Beukers 等人，*Journal of Medicinal Chemistry* **2004**, 47(15), 3707-3709 中所述之方法。其中 R^4 為 Cl 之式 **1d** 化合物可藉由以亞硫醯氯或五氯化磷於鹼如三乙胺或吡啶存在下於溶劑如二氯甲烷或吡啶中在 25 至 110°C 處理而製備。其中 R^4 為 I 之式 **1d** 化合物可藉由使對應之式 **1c** 化合物與碘化鈉或碘化鉀在 25 至 70°C 於 $\text{BF}_3 \cdot \text{Et}_2\text{O}$ 與醚溶劑如 1,4-

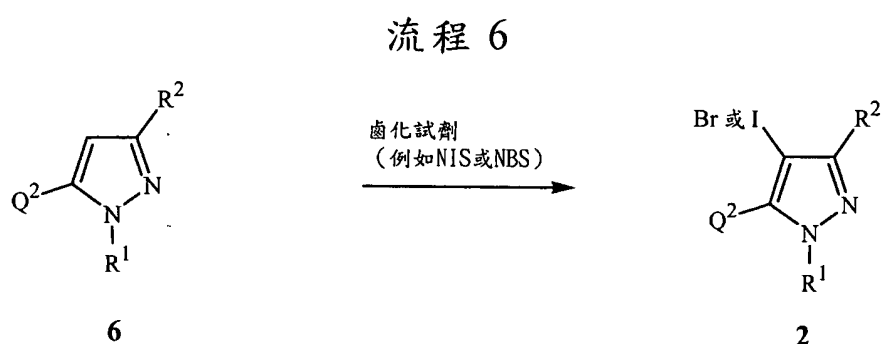
二【口+罅】烷(1,4-dioxane)存在下反應而製備，或者與氫碘酸於溶劑如乙腈中反應而製備，此係依據 *Tetrahedron Letters* **2001**, 42, 951-953 以及 *Journal of the American Chemical Society* **1965**, 87, 539-42 中所述之通用方法。

流程 5



如流程 6 所示，式 2 之吡唑中間物係藉由以鹵化劑處理而迅速製備自對應之式 6 吡唑。適用於此方法之鹵化劑包括 *N*-溴琥珀醯亞胺(NBS)、*N*-碘琥珀醯亞胺(NIS)、溴、亞溴酸鈉、亞硫醯氯、草醯氯、苯膦醯二氯或光氣。特別有用者為 *N*-溴琥珀醯亞胺(NBS)與 *N*-碘琥珀醯亞胺(NIS)。適用於此反應之溶劑包括例如 *N,N*-二甲基甲醯胺、*N,N*-二甲基乙醯胺、二氯甲烷、氯仿、氯丁烷、苯、二甲苯、氯苯、四氫呋喃、對二【口+罅】烷、乙腈與類似者。選擇性地，可加入有機鹼如三乙胺、吡啶、*N,N*-二甲基苯胺與類似者。典型反應溫度範圍從約環境溫度至 200°C。關於代表性程序，請參

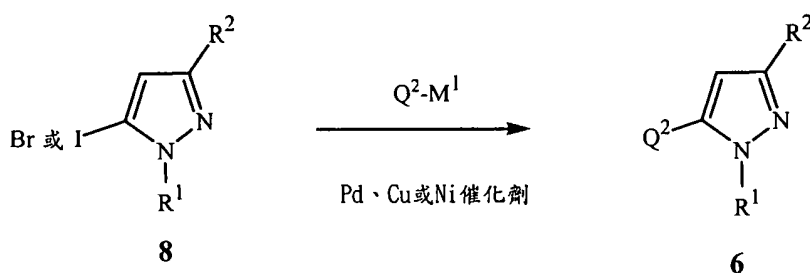
見 Czarnocki 等人, *Synthesis* **2006**, 17, 2855-2864; Brana 等人, *Journal of Medicinal Chemistry* **2005**, 48, 6843-6854; Liu 等人, *Journal of Medicinal Chemistry* **2007**, 50, 3086-3100 以及 Chan 等人, *Journal of Medicinal Chemistry* **2005**, 48, 4420-4431。流程 6 之方法亦說明於實例 4 步驟 C、實例 3 步驟 C 與實例 9 步驟 D。



如流程 7 所示，式 6 化合物可藉由式 8 之 4-溴或 4-碘吡唑於過渡金屬催化交叉偶合反應條件下反應而製備。在此方法中，使式 8 之吡唑與式 Q^2-M^1 化合物於合適之鈮、銅或鎳催化劑存在下反應，以產生對應之式 6 化合物。在此方法中，式 Q^2-M^1 化合物為有機硼酸（例如 M^1 為 $B(OH)_2$ ）、有機硼酸酯（例如 M^1 為 $B(-OC(CH_3)_2C(CH_3)_2O-)$ ）、有機三氟硼酸鹽（例如 M^1 為 BF_3K ）、有機錫試劑（例如 M 為 $Sn(n-Bu)_3$ 、 $Sn(Me)_3$ ）、格任亞試劑（例如 M^1 為 $MgBr$ 或 $MgCl$ ）或有機鋅試劑（例如 M^1 為 $ZnBr$ 或 $ZnCl$ ）。合適之金屬催化劑包括但不限於：醋酸鈮(II)、氯化鈮(II)、肆(三苯基膦)鈮(0)、

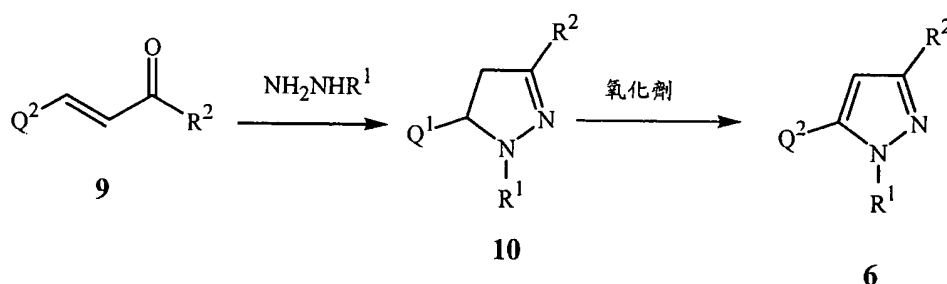
雙(三苯基膦)二氯化鈹(II)、二氯[1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵]鈹(II)、雙(三苯基膦)二氯化鎳(II)與銅(I)鹽(例如碘化銅(I)、溴化銅(I)、氯化銅(I)、氰化銅(I)或三氟甲磺酸銅(I))。各個反應之最佳條件會取決於所用之催化劑與連接至該偶合試劑(即 M^1)之相對離子,如熟習該項技術者所理解者。在一些例子中,加入配體如經取代膦或經取代雙膦基烷烴(bisphosphinoalkane)會增進反應性。再者,鹼如鹼金屬碳酸鹽、三級胺或鹼金屬氯化物的存在,對於一些涉及式 Q^2-M^1 之有機硼試劑的反應可能為必要。關於此類反應之回顧,請參見:E. Negishi, *Handbook of Organopalladium Chemistry for Organic Synthesis*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 2002; N. Miyaura, *Cross-Coupling Reactions: A Practical Guide*, Springer, New York, 2002; H. C. Brown 等人, *Organic Synthesis via Boranes*, 第3卷, Aldrich Chemical Co., Milwaukee, WI, 2002; Suzuki 等人, *Chemical Review* **1995**, 95, 2457-2483 以及 Molander 等人, *Accounts of Chemical Research* **2007**, 40, 275-286。再者,實例9步驟C說明使用流程7之方法合成一式6化合物。

流程 7

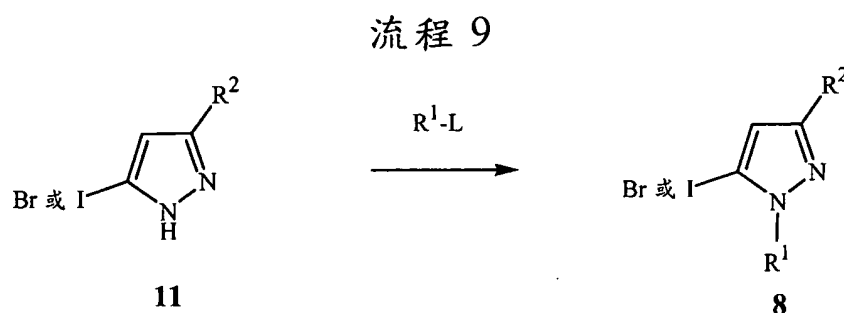


或者，如流程 8 所示，式 6 化合物可藉由使式 9 烯酮與一合適之經取代式 NH_2NHR^1 肼進行環化反應並接著與式 10 吡唑進行氧化反應而製備。有用之氧化試劑包括溴（相關條件請參見例如 *Indian Journal of Heterocyclic Chemistry*, **2001**, 11(1), 21-26）、元素硫、二氧化錳、2,3-二氯-5,6-二氰基苯醌(DDQ)、氯醌（相關條件請參見例如 *Russian Journal of Organic Chemistry* **2006**, 42(8), 1113-1119）與氧，選擇性地於金屬催化劑如醋酸鈷（相關條件請參見例如 *Tetrahedron* **2006**, 62(11), 2492-2496, *Chinese Chemical Letters* **2008**, 19(9), 1013-1016）存在下。可用於此反應之溶劑包括 *N,N*-二甲基甲醯胺、四氫呋喃、甲苯、水、二氯甲烷、四氯乙烷與這些或相似溶劑之混合物，在環境溫度至 200°C 的溫度。肼與烯酮之反應與烯酮之製備在該項技術中為熟知者（請參見例如 *Berichte der Deutschen Chemischen Gesellschaft [Abteilung] B: Abhandlungen* **1925**, 58B, 1974-86 以及 *Journal of the American Chemical Society* **1958**, 80, 5524-7）。再者，實例 4 步驟 B 說明藉由流程 8 之方法合成一式 6 化合物。

流程 8



如流程 9 所示，式 8 化合物可藉由使對應之式 11 吡唑與式 R^1 -L 烷化劑進行烷化反應而製備，其中 L 為脫離基如鹵素或(鹵)烷磺酸鹽（例如 Cl、Br、I、對甲苯磺酸鹽、甲磺酸鹽或三氟甲磺酸鹽）。用於此類烷化反應之通用程序在該項技術中為熟知者，並可迅速應用於製備本發明之化合物。用於製備式 8 化合物（其中 R^1 為甲基者）之特別有用烷化劑為重氮甲烷或碘甲烷，其使用該項技術中習知的通常程序，如描述於 *Journal of Heterocyclic Chemistry* 1988，1307-1310 中者。實例 9 步驟 B 說明用於製備式 8 化合物（其中 R^1 為甲基者）之流程 9 方法。

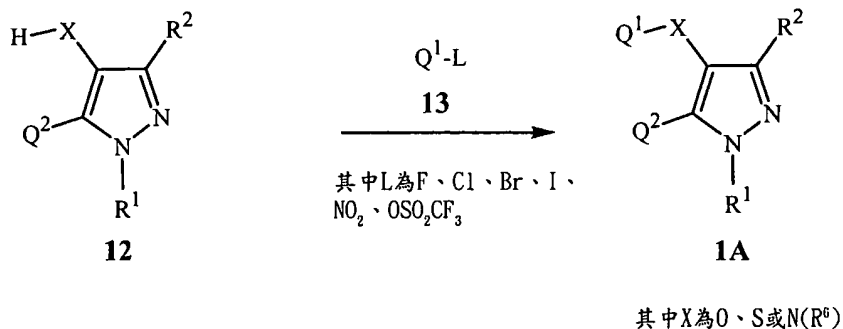


式 11 之起始化合物為習知且可以化學文獻中所揭露的各式方法製備。關於一特定實例，請參見實例 9 步驟 A。

如流程 10 所示，式 1A 化合物亦可藉由使式 12 化合物（例如對於 X 為 $N(R^6)$ 者即式 12 之 4-胺基吡唑、對於 X 為 O 者即式 12 之 4-羥基吡唑(4-吡唑啉)，以及對於 X 為 S 者即式 12 之 4-巯基吡唑）與式 13 化合物

(其中 L 為脫離基如鹵素或(鹵)烷磺酸鹽(例如 Cl、Br、I、對甲苯磺酸鹽、甲磺酸鹽或三氟甲磺酸鹽)), 選擇性地於金屬催化劑存在下及通常於鹼與極性非質子性溶劑如 *N,N*-二甲基甲醯胺或二甲亞碲存在下反應而製備。式 13 化合物(其中 Q^1 為經拉電子取代基取代之苯環)藉由直接由 Q^1 上置換該脫離基 L 而與式 12 化合物反應, 以提供式 1A 化合物。典型用於這些種類反應之 L 為 F 或 Cl。式 13 化合物(其中 Q^1 為未經拉電子取代基取代之苯環), 或者一般而言為了提高反應速率、產率或產物純度, 使用範圍在催化量到至多超化學計量的金屬催化劑(例如金屬或金屬鹽)量可利於所欲反應。典型用於這些條件之 L 為 Br 或 I 或一磺酸鹽如 $-\text{OS}(\text{O})_2\text{CF}_3$ 或 $-\text{OS}(\text{O})_2(\text{CF}_2)_3\text{CF}_3$ 。例如, 反應可於金屬觸媒如銅鹽錯合物(例如帶有 *N,N'*-二甲基乙二胺、脯胺酸或聯吡啶之 CuI)、鈹錯合物(例如參(二亞苳丙酮)二鈹(0))或鈹鹽(例如醋酸鈹)與配體如 4,5-雙(二苯基膦基)-9,9-二甲[口+山][口+星](4,5-bis(diphenylphosphino)-9,9-dimethylxanthene)、2-二環己膦基-2',4',6'-三異丙基聯苯或 2,2'-雙(二苯基膦基)1,1'-聯二萘, 與鹼如碳酸鉀、碳酸鈹、酚鈉或三級丁氧化鈉存在下, 在溶劑如 *N,N*-二甲基甲醯胺、1,2-二甲氧乙烷、二甲亞碲、1,4-二【口+号】烷或甲苯中進行, 該溶劑選擇性地含有醇如乙醇。流程 10 之方法係說明於實例 1 步驟 C 與實例 2 步驟 G。

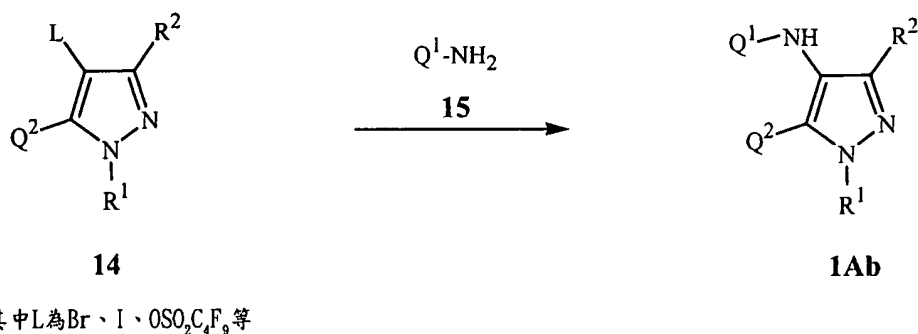
流程 10



式 12 化合物為市售可得且其製備為該項技術中習知者；請參見例如 *Journal für Praktische Chemie (Liepzig)* 1911, 83, 171-182 以及 *Journal of the American Chemical Society* 1954, 76, 501-503。並且，本實例 1 步驟 A 至 B 與實例 2 步驟 A 至 F 說明用於製備式 12 之 4-胺基吡唑的方法。

如流程 11 所說明，式 1Ab 化合物（即其中 X 為 NH 之式 1A）亦可藉由使式 14 化合物與式 15 化合物在金屬催化條件（類似於上述用於流程 7 者）下反應而製備。

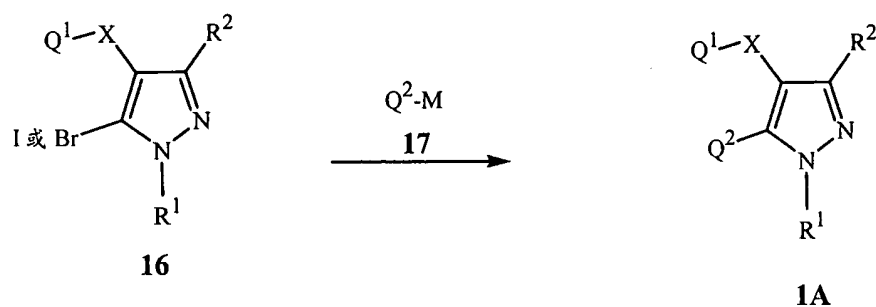
流程 11



式 14 化合物為習知且可藉由流程 6 所揭露之方法而製備，並且可藉由化學文獻中所揭露的各式方法製備。

如流程 12 所示，式 1A 化合物可藉由使式 16 之 5-溴或 5-碘吡唑與式 17 之有機金屬化合物在過渡金屬催化交叉偶合反應條件（類似描述用於流程 7 者）下反應而製備。使式 16 吡唑與式 16 之硼酸、三烷基錫、鋅或有機鎂試劑於鈀或鎳催化劑存在下，並選擇性地於配體（例如三苯基膦、二亞苄丙酮、二環己基(2',6'-二甲氧基[1,1'-聯苯]-2-基)膦)與鹼存在下（若需要時）反應，以產生對應之式 1A 化合物。例如，使式 17 化合物（其中 M 為 $B(OH)_2$ 、 $B(OC(CH_3)_2C(CH_3)_2O)$ 、 $B(O-i-Pr)_3$ Li 者）與式 16 之 5-溴或 5-碘吡唑於二氯雙(三苯基膦)鈀(II)與鹼如碳酸鈉或氫氧化鉀之水溶液存在下，在溶劑例如 1,4-二【口+号】烷、1,2-二甲氧乙烷、甲苯或乙醇中反應，或在使用配體如氧化膦或亞磷酸鹽配體（例如二苯基氧化膦）與氟化鉀在溶劑如 1,4-二【口+号】烷之無水條件下反應，以提供對應之式 1A 化合物（相關參考文獻請參見 *Angewandte Chemie, International Edition* 2008, 47(25), 4695-4698）。流程 12 之方法係說明於實例 3 步驟 D。

流程 12



式 16 化合物可經由類似於流程 6 所述者與實例 3 步驟 C 所說明者之鹵化方法而製備。

熟習該項技術者會認知到的是各式官能基可轉化為其他者以提供不同之式 1 或式 1A 化合物。例如，其中 R^2 為甲基、乙基或環丙基之式 1 或式 1A 化合物可藉由自由基鹵化反應改質，以形成其中 R^2 為鹵甲基或鹵環丙基之式 1 或式 1A 化合物。該鹵甲基化合物可用作為中間物，以製備其中 R^2 為羥甲基或氰甲基之式 1 或式 1A 化合物。式 1、式 1A 化合物或用於其製備之中間物可含有芳香族硝基基團，其可還原為胺基基團，而後經由該項技術中所熟知之反應（例如山德邁耳反應 (Sandmeyer reaction)）轉化為各式鹵化物，以提供其他式 1 或式 1A 化合物。藉由類似之習知反應，芳族胺（苯胺）可經由重氮鹽轉化為酚，其而後可經烷基化以製備帶有烷氧基取代基之式 1 或式 1A 化合物。同樣地，經由山德邁耳反應製備的芳族鹵化物如溴化物或碘化物可在銅催化條件（如烏耳曼反應 (Ullmann reaction) 或其已知的修改）下與醇類反應，以提供含有烷氧基取代基

的式 1 或式 1A 化合物。此外，鹵素基團如氟或氯可在鹼性條件下以醇類置換，以提供含有對應之烷氧基取代基的式 1 或式 1A 化合物。所得烷氧基化合物本身可用於進一步反應，以製備其中 R^{3a} 為 -U-V-T 之式 1 或式 1A 化合物（請參見例如 PCT 公開第 WO 2007/149448 A2 號）。其中 R^2 為鹵化物（較佳為溴化物或碘化物）之式 1、式 1A 化合物或其前驅物，係用於過渡金屬催化交叉偶合反應以製備式 1 或式 1A 化合物之特別有用中間物。這些類型的反應係詳細記載在文獻中；請參見例如 Tsuji 於 *Transition Metal Reagents and Catalysts: Innovations in Organic Synthesis*, John Wiley and Sons, Chichester, 2002；Tsuji 於 *Palladium in Organic Synthesis*, Springer, 2005；以及 Miyaura and Buchwald 於 *Cross Coupling Reactions: A Practical Guide*, 2002；及其中引用的參考文獻。

可認知到，上述用於製備式 1 或式 1A 化合物的一些試劑及反應條件，可能無法與某些存在於中間物中的官能度相容。在這些實例中，併入保護/去保護次序或官能基相互轉換至該合成中，將有助於獲得所欲產物。該保護基的使用及選擇對於熟習化學合成之人士會是顯而易見的（請參見例如 Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 第 2 版；Wiley: New York, 1991）。熟習該項技術者會認知到，在一些情況下，在引入一特定試劑（如同其在任何個別流程中所述者）後，其可能必須進行未詳述之額外常規步驟以完成式 1 與式 1A 化合物之合成。熟習該項技術者亦會

認知到，可能必須以不同於所呈現之特定順序所意味的次序，來進行以上流程中所說明步驟之組合以製備式 1 與式 1A 化合物。

熟習該項技術者亦會認知到，式 1、式 1A 化合物與本文中所述之中間物可經過各式親電子、親核、自由基、有機金屬、氧化與還原反應以加入取代基或改質現有取代基。

即使沒有進一步的闡述，相信使用上述說明的熟習該項技術者仍能夠最大程度地利用本發明。因此，以下實例僅為說明之用，而絕非用於限制本發明之揭露內容。下列實例的步驟說明一整體合成轉變之各步驟的一個製程，且用於每個步驟的起始原料可能不一定需要藉由一特定製備路程來製備，該特定製備路程的製程係在其他實例或步驟中有敘述者。百分率為按重量計，除了層析溶劑混合物或另有指明者。除非特別指出，則層析溶劑混合物係體積份及體積百分比。MPLC 係指在矽膠上的中壓液相層析。¹H NMR 光譜係以偏移自四甲基矽烷之低場 ppm 來記述；「s」意指單峰，「d」意指雙重峰，「t」意指三重峰，「m」意指多重峰，「dd」意指雙重峰的雙重峰，「dt」意指三重峰的雙重峰而「br s」意指寬單峰。

實例 1

4-[[5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基]胺基]-3,5-二氟苯甲腈（化合物 40）的製備

步驟 A： 5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-4-硝基-1*H*-吡唑的製備

將 5-氯-1,3-二甲基-4-硝基-1*H*-吡唑(2.50 g, 14.3 mmol)、2-氯-4-氟苯硼酸(2.98 g, 17.2 mmol)、碳酸銨(5.58 g, 17.2 mmol)與二氯[1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵]鈦(II)二氯甲烷錯合物(1:1) (1.16 g, 1.43 mmol)在二【口+罅】烷(50 mL)中之混合物在 100°C 加熱約 2.5 天。在冷卻至室溫後，使反應混合物經過在燒結玻璃漏斗上之 Celite® (矽藻土) 墊過濾並且在減壓下濃縮濾液。將所得材料溶於乙酸乙酯中並經過在燒結玻璃漏斗上之二氧化矽柱塞過濾，並且在減壓下濃縮濾液。使所得材料藉由矽膠管柱層析(5 至 40% 梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液)純化以提供標題化合物(0.32 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.32-7.26 (m, 2H), 7.16-7.09 (m, 1H), 3.58 (s, 3H), 2.57 (s, 3H)。

步驟 B： 5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-胺的製備

將 5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-4-硝基-1*H*-吡唑(即步驟 A 之產物) (0.2 g, 0.74 mmol)、鐵粉(0.2 g, 3.6 mmol)與飽和氯化銨水溶液(1 mL)在乙醇(5 mL)中之混合物在 80°C 加熱 4 小時。在冷卻至室溫後，將反應混合物以乙酸乙酯稀釋並經過在燒結玻璃漏斗之 Celite® (矽藻土) 墊過濾。在減壓下濃縮濾液並使所得材料藉由矽膠管柱層析(乙酸乙酯作為洗提液)純化以提供標題化合物(0.14 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.36-7.20 (m, 2H), 7.17-7.05 (m, 1H), 3.57 (s, 3H), 2.66 (br s, 2H), 2.24 (s, 3H)。

步驟 C： 4-[[5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基]胺基]-3,5-二氟苯甲腈的製備

將 5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-胺 (即步驟 B 之產物) (0.25 g, 1.0 mmol)、3,4,5-三氟苯甲腈 (0.188 g, 1.2 mmol) 與碳酸鉍 (0.390 g, 1.2 mmol) 在乙腈 (3 mL) 中之混合物在 210°C 下在 Biotage Initiator™ 微波裝置中加熱 2 小時。在冷卻至室溫後，將反應混合物以乙酸乙酯稀釋並經過在燒結玻璃漏斗上之矽膠墊過濾。在減壓下濃縮濾液並使所得材料藉由矽膠層析 (30% 之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 純化以提供標題化合物，其為呈固體之本發明化合物 (0.065 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.34-7.16 (m, 2H), 7.04 (m, 3H), 5.27 (br s, 1H), 3.64 (s, 3H), 2.18 (s, 3H)。

實例 2

4-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-胺 (化合物 45) 的製備

步驟 A： 3-(甲胺基)-2-丁烯酸甲酯的製備

於乙醯乙酸甲酯 (23.2 g, 0.2 mol) 在水 (15 mL) 中之混合物中在 10°C 下以滴加方式加入甲胺 (40% 水溶液, 18.6 g, 0.24 mol)。使反應混合物溫熱至室溫並攪拌 2 小時。將所得固體沉澱物藉由過濾收集並以冰水 (2x) 洗

滌，而後在真空烘箱中在 55°C 下乾燥整夜以提供呈白色固體標題化合物(20.9 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 8.45 (br s, 1H, NH), 4.47 (s, 1H), 3.62 (s, 3H), 2.91 (d, 3H), 1.92 (s, 3H)。

步驟 B： 2-氯-4-氟- α -[1-(甲胺基)亞乙基]- β -側氧苯丙酸甲酯

於 3-(甲胺基)-2-丁烯酸甲酯 (即步驟 A 之產物) (10.25 g, 79.43 mmol)與三乙胺(13.26 mL, 9.63 g, 95.31 mmol)在甲苯(125 mL)中之混合物中在 0°C 在 30 分鐘期間以滴加方式加入在甲苯(25 mL)中之 2-氯-4-氟苯甲醯氯(15.25 g, 79.48 mol)，同時維持反應混合物之溫度在約 0 至 5°C 間。使反應混合物溫熱至室溫並攪拌整夜。將反應混合物過濾並且在減壓下濃縮濾液。將所得暗黃色油以己烷研製並過濾以提供呈白色固體之標題化合物(15.91 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 12.60 (s, 1H), 7.20-6.90 (m, 3H), 3.30 (s, 3H), 3.11 (s, 3H), 2.35 (s, 3H)。

步驟 C： 5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-羧酸甲酯的製備

將 2-氯-4-氟- α -[1-(甲胺基)亞乙基]- β -側氧苯丙酸甲酯 (即步驟 B 之產物) (15.91 g, 55.82 mmol)與甲胍(3 mL, 56 mmol)在二乙醚(150 mL)中之混合物在室溫攪拌 48 小時。在減壓下濃縮反應混合物以提供呈無色油之標題化合物(15 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.32-7.25 (m, 2H), 7.10 (dt, 1H), 3.59 (s, 3H), 2.64 (s, 3H), 2.51 (s, 3H)。

步驟 D： 5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-羧酸的製備

將 5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-羧酸甲酯（即步驟 C 之產物）(12.33 g, 43.7 mol)與氫氧化鈉 (1 N, 70 mL)在甲醇(70 mL)中之混合物在回流下加熱 2 小時。將反應混合物冷卻至約 0°C，而後將反應混合物之 pH 調整至 3（藉由加入氫氯酸水溶液(1 N)）。將反應混合物以乙酸乙酯(3 × 70 mL)萃取並將合併之萃取物以飽和氯化鈉水溶液洗滌，以硫酸鎂乾燥並過濾。在減壓下濃縮濾液以提供呈白色固體之標題化合物(11.14 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 12.00 (br s, 1H), 7.70-7.45 (m, 2H), 7.35 (dt, 1H), 3.48 (s, 3H), 2.37 (s, 3H)。

步驟 E： *N*-[5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基]胺基甲酸甲酯的製備

將 5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲酸（即步驟 D 之產物）(10.14 g, 37.8 mmol)、二苯疊氮磷醯(diphenyl phosphoryl azide) (8.15 mL, 10.4 g, 37.8 mmol)與三乙胺(6.32 mL, 4.59 g, 45.4 mmol)在甲苯(100 mL)中之混合物在室溫下攪拌 2 小時。在 2 小時後，將反應混合物以滴加方式加入甲苯(100 mL)並在回流下加熱 2 小時。將反應混合物冷卻至約 70°C，將甲醇(30

mL)以滴加方式加入，並將混合物再次在回流下加熱額外 40 分鐘。將反應混合物以水(100 mL)稀釋、以乙酸乙酯(2 × 40 mL)萃取並將合併之萃取物以飽和氯化鈉水溶液萃取，以硫酸鎂乾燥並過濾。在減壓下濃縮濾液以提供淺黃色固體之標題化合物(9.77 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.42-7.26 (m, 2H), 7.08 (dt, 1H), 5.68 (br s, 1H, NH), 3.66 (br s, 3H), 3.62 (s, 3H), 2.24 (s, 3H)。

步驟 F: 5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-胺的製備

將 *N*-[5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基]胺基甲酸酯(步驟 E 之產物)(7.07 g, 23.8 mmol)與氫氧化鈉水溶液(1 N, 70 mL)在甲醇(70 mL)中之混合物在回流下加熱 20 小時。在減壓下濃縮反應混合物、以水稀釋並以乙酸乙酯(2 × 30 mL)萃取。將合併之有機層以氫氯酸(1 N, 2 × 30 mL)萃取，並且將合併之含水萃取物的 pH 藉由加入氫氧化鈉(1 N)調整至 10。將含水混合物以乙酸乙酯(2 × 40 mL)萃取。將合併之有機萃取物以飽和氯化鈉水溶液洗滌，以硫酸鎂乾燥、過濾並在減壓下濃縮以提供呈黏性黃色油之標題化合物(4.36 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.35-7.28 (m, 2H), 7.11 (m, 1H), 3.57 (s, 3H), 2.60 (br s, 2H, NH_2), 2.23 (s, 3H)。

步驟 G: 4-(4-氯-2-氟苯基)-5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-胺的製備

將 5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-胺 (即步驟 F 之產物) (7.07 g, 23.8 mmol)、4-氯-2-氟碘苯 (256 μ L, 2.0 mmol)、三級丁氧化鈉 (0.192 g, 2.0 mmol) 與 [1,1'-雙(二苯膦)二茂鐵]二氯鈮(II) (0.117 g, 0.16 mmol) 在甲苯 (5 mL) 中之混合物在 180°C 在 Biotage Initiator™ 微波裝置中加熱 1 小時。將所得材料藉由快速層析在矽膠 (40 g)、Varian Bond Elute SI® 管柱 (30% 之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 純化以提供標題化合物, 其為呈暗紫色/棕色油之本發明化合物 (164 mg)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.26-7.15 (m, 2H), 7.03-6.95 (m, 2H), 6.75 (dt, 1H), 6.45-6.40 (m, 1H), 5.20 (s, 1H, NH), 3.67 (s, 3H), 2.13 (s, 3H)。

實例 3

4-(2-氯-4-氟苯氧基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑 (化合物 5) 的製備

步驟 A: 1-(2-氯-4-氟苯氧基)-2-丙酮的製備

將 2-氯-4-氟酚 (3.00 g, 20.4 mmol)、氯丙酮 (2.12 mL, 26.6 mmol)、碳酸鉀 (4.24 g, 30.7 mmol) 與碘化鉀 (0.20 g, 催化級) 在丙酮 (30 mL) 中之混合物在回流下加熱 4 小時、冷卻並過濾。在減壓下濃縮濾液以提供黃色固體之標題化合物 (4.05 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.16 (dd, $J = 8.0, 3.0$ Hz, 1H), 6.93 (m, 1H), 6.76 (m, 1H), 4.53 (s, 2H), 2.34 (s, 3H)。

步驟 B： 4-(2-氯-4-氟苯氧基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑的製備

將 1-(2-氯-4-氟苯氧基)-2-丙酮 (即步驟 A 之產物) (1.40 g, 6.93 mmol) 與 *N,N*-二甲基甲醯胺二甲基縮醛 (1.38 mL, 10.4 mmol) 之混合物加熱至 90°C 達 3 小時，而後在減壓下濃縮。將所得材料以乙醇 (15 mL) 稀釋，而後將甲胛 (0.49 mL, 9.0 mmol) 與乙酸 (0.1 mL) 加入。在 15 小時後，在減壓下濃縮反應混合物並將所得材料藉由矽膠管柱層析 (5 至 40% 梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 純化，以提供呈棕黃色油之標題化合物 (680 mg)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.16 (m, 2H), 6.78-6.88 (m, 2H), 3.81 (s, 3H), 2.10 (s, 3H)。

步驟 C： 5-溴-4-(2-氯-4-氟苯氧基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑的製備

在 4-(2-氯-4-氟苯氧基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑 (即步驟 B 之產物) (680 mg, 2.82 mmol) 與碳酸鈉 (389 mg, 3.67 mmol) 在二氯甲烷 (12 mL) 中之混合物在 -40°C 下加入溴 (474 mg, 2.96 mmol) 在二氯甲烷 (1 mL) 中之溶液。在加入完成後，將反應混合物溫度在約 -30 至 -20°C 維持 5 小時。將反應混合物以二氯甲烷 (50 mL) 稀釋並以水 (2 × 10 mL) 與氯化鈉水溶液洗滌，以硫酸鈉乾燥、過濾並在減壓下濃縮以提供呈黃色固體之標題化合物 (720 mg)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.18 (dd, $J = 8.0, 3.0$ Hz, 1H), 6.87 (m, 1H), 6.67 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 2.10 (s, 3H)。

步驟 D： 4-(2-氯-4-氟苯氧基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑的製備

將 5-溴-4-(2-氯-4-氟苯氧基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑 (即步驟 C 之產物) (250 mg, 0.78 mmol) 在 1,2-二甲氧乙烷/水 (5 mL, 2:1) 之混合物以氫之次表面氣流鼓泡 30 分鐘，而後將 2,4-二氟苯硼酸 (371 mg, 2.34 mmol)、碳酸鉀 (1.08 g, 7.82 mmol) 與 4-(三苯基膦)鈀 (90 mg, 0.078 mmol) 加入。將反應混合物加熱至 80°C 達 15 小時，而後冷卻並以乙酸乙酯萃取。將有機層以水與飽和氯化鈉水溶液洗滌，以硫酸鈉乾燥、過濾並在減壓下濃縮。將所得材料藉由矽膠管柱層析 (5 至 30% 梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 純化以提供標題化合物，其為呈淺黃色固體之本發明化合物 (150 mg) 並在 70-72°C 下熔化。

¹H NMR (CDCl₃): δ 7.27 (m, 1H), 7.07 (dd, *J* = 8.0, 3.0 Hz, 1H), 6.90 (m, 2H), 6.79 (m, 1H), 6.69 (m, 1H), 3.71 (s, 3H), 2.12 (s, 3H)。

實例 4

α-(2,4-二氟苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇 (化合物 14) 的製備

步驟 A： 4-(2,6-二氟苯基)-3-丁烯-2-酮的製備

在 2,6-二氟苯甲醛 (10.0 g, 70 mmol) 在丙酮 (85 mL) 中之混合物中加入氫氧化鈉 (1 N 溶液, 106 mL)。在室溫下攪拌 1.5 小時後，將反應混合物以飽和氯化鈉水

溶液稀釋並以氯仿(2×150 mL)萃取。將合併之有機層以硫酸鎂乾燥、過濾並在減壓下濃縮。將所得材料藉由 MPLC (0 至 20% 梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 純化以產出呈固體之標題產物(8.1 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.61 (d, 1H), 7.16 (m, 1H), 6.98 (m, 3H), 2.39 (s, 3H)。

步驟 B: 5-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑的製備

於 4-(2,6-二氟苯基)-3-丁烯-2-酮(即步驟 A 之產物) (8.1 g, 44.5 mmol) 在乙醇(50 mL)中之混合物中加入甲肼(2.1 g, 49 mmol)。在 24 小時後，在減壓下濃縮反應混合物。於所得油(10.1 g)中加入 1,1,2,2-四氯乙烷(65 mL)與氧化錳(41.7 g, 480 mmol)。將反應混合物在 140 °C 下加熱 20 分鐘，而後冷卻至常溫並經過經燒結玻璃料漏斗上之 Celite® (矽藻土) 墊過濾並以二氯甲烷(2×20 mL)潤洗。在減壓下濃縮濾液並將所得材料藉由 MPLC (10 至 50% 梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 純化以提供淺黃色固體之標題化合物(4.02 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.38 (m, 1H), 7.01 (m, 2H), 6.17 (s, 1H), 3.71 (s, 3H), 2.32 (s, 3H)。

步驟 C: 4-溴-5-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑的製備

於 5-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑(即步驟 B 之產物) (1.53 g, 7.3 mmol) 在 *N,N*-二甲基甲醯胺(20 mL)

中之混合物中在 0°C 下以滴加方式加入 *N*-溴琥珀醯亞胺(1.37 g, 7.7 mmol)。在加入完成後，使反應混合物溫熱至室溫並攪拌 1 小時。將反應混合物以冰水(20 mL)與飽和亞硫酸氫鈉水溶液(15 mL)稀釋，短暫攪拌，而後分配在水(75 mL)與乙酸乙酯(100 mL)間。將層分離並將水層以乙酸乙酯(100 mL)萃取。將合併之有機層以飽和氯化鈉水溶液(100 mL)洗滌，以硫酸鎂乾燥、過濾並在減壓下濃縮。使所得材料藉由 MPLC (10 至 40% 梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液)純化以提供呈固體之標題化合物(1.84 g)。

¹H NMR (CDCl₃): δ 7.52-7.42 (m, 1H), 7.10-7.01 (m, 2H), 3.71 (s, 3H), 2.30 (s, 3H)。

步驟 D: α-(2,4-二氟苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇的製備

於 4-溴-5-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑 (即步驟 C 之產物) (500 mg, 1.7 mmol) 在四氫呋喃(15 mL)中之混合物中在 -78°C 以滴加方式加入正丁基鋰 (2.0 M 在己烷中, 0.76 mL, 1.9 mmol)。將反應混合物在 -78°C 攪拌約 20 分鐘，而後將 2,4-二氟苯甲醛(153 μL, 1.4 mmol)在四氫呋喃(1 mL)中之溶液以滴加方式加入。在加入完成後，將反應混合物在約 -78 至 0°C 攪拌約 15 分鐘，而後以飽和氯化銨水溶液(1 mL)稀釋並使其溫熱至室溫。將所得混合物倒入固相萃尿管 (Varian Chem Elute®, 以矽藻土預填充) 並以乙酸乙酯(50 mL)洗提。在減壓下濃縮乙酸乙酯洗提液並使所得材料藉由

MPLC (20 至 50%梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 純化以提供標題化合物，其為呈固體之本發明化合物(560 mg)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.41-7.32 (m, 2H), 7.01-6.90 (m, 1H), 6.89-6.82 (m, 1H), 6.68-6.56 (m, 2H), 5.82 (d, 1H), 3.60 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.08 (br s, 1H)。

實例 5

5-(2,6-二氟苯基)-4-[(2,4-二氟苯基)氟甲基]-1,3-二甲基-1*H*-吡唑 (化合物 68) 的製備

於 α -(2,4-二氟苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇 (即實例 4 之產物) (70 mg, 0.20 mmol) 在二氯甲烷(2 mL)中之混合物中在 -78°C 加入雙(2-甲氧乙基)胺硫(Deoxo-Fluor®) (40 μL , 0.24 mmol)。將反應混合物在室溫攪拌整夜，而後冷卻至 -78°C 並將飽和碳酸氫鈉水溶液(3 mL)以滴加方式加入。將所得混合物以二氯甲烷(3 x)萃取並將合併之有機層以硫酸鎂乾燥、過濾並在減壓下濃縮。使所得材料藉由 MPLC (50%梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 純化以提供標題化合物，其為呈固體之本發明化合物(30 mg)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.40-7.31 (m, 1H), 7.28-7.20 (m, 1H), 6.98-6.82 (m, 2H), 6.70-6.62 (m, 2H), 6.52 (d, 1H), 3.61 (s, 3H), 2.20 (s, 3H)。

實例 6

4-[(4-氯苯基)硫基]-5-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑
(化合物 56) 的製備

於 4-溴-5-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑 (即實例 4 步驟 C 之產物) (250 mg, 0.87 mmol) 在四氫呋喃中之混合物中在 -78°C 以滴加方式加入正丁基鋰 (2.5 M 在己烷中, 0.38 ml, 0.96 mmol)。將反應混合物在約 -78 至 0°C 攪拌 15 分鐘, 而後將在四氫呋喃 (1 mL) 中之 4,4'-二氯二硫二苯 (0.25 g, 0.87 mmol) 加入。在約 10 分鐘後, 將反應混合物以飽和氯化銨水溶液稀釋並使其溫熱至室溫。將所得混合物倒入固相萃取管 (Varian Chem Elute®, 以矽藻土預填充) 並以乙酸乙酯洗提。在減壓下濃縮乙酸乙酯洗提液並使所得材料藉由 MPLC (10 至 50% 梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 純化以提供標題化合物, 其為呈油狀之本發明化合物 (130 mg)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.45-7.38 (m, 1H), 7.15-7.10 (d, 2H), 7.01-6.92 (m, 2H), 6.93-6.85 (d, 2H), 3.75 (s, 3H), 2.22 (s, 3H)。

實例 7

(2,4-二氟苯基)-[5-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基]
甲酮 (化合物 32) 的製備

於氯化鋁 (380 mg, 2.88 mmol) 在四氯乙烷 (10 mL) 中之混合物中在約 0°C 加入 2,4-二氟苯甲醯氯 (0.36 mL, 2.88 mmol)。將反應混合物攪拌約 30 分鐘, 而後將在四

氯乙烷(0.5 mL)中之 5-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑(藉由類似於實例 4 步驟 A-B 的方法製備並以 2,4-二氟苯甲醛起始)加入。使反應混合物溫熱至室溫、攪拌 1 小時，而後在回流下加熱 24 小時。將反應混合物冷卻至室溫、倒入至冰/氫氯酸之混合物並以二氯甲烷(3 x)萃取。將合併之有機層以飽和氯化鈉水溶液洗滌，以硫酸鎂乾燥、過濾並在減壓下濃縮。使所得材料藉由 MPLC (50%梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液)純化以提供標題化合物，其為呈固體之本發明化合物(0.16 g)。

^1H NMR (CDCl_3) δ 7.28-7.38 (m, 1H), 7.08-7.01 (m, 1H), 6.79-6.70 (m, 3H), 6.50-6.42 (m, 1H), 3.67 (s, 3H), 2.48 (s, 3H)。

實例 8

α -(2,4-二氟苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基
醇(化合物 72)的製備

於(2,4-二氟苯基)-[5-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基]甲酮(即實例 7 之產物)(80 mg, 0.23 mmol)在乙醇(3 mL)中之混合物中在約 0°C 加入硼氫化鈉(38 mg, 0.92 mmol)。將反應混合物在室溫攪拌 2 小時，而後以冰/氫氯酸(約 1 mL)稀釋。將所得混合物倒入固相萃取管(Varian Chem Elute®，以矽藻土預填充)並以乙酸乙酯(75 mL)洗提。在減壓下濃縮乙酸乙酯洗提液並使所得材料藉由 MPLC(20 至 70%梯度之在

己烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 純化以提供標題化合物，其為呈固體之本發明化合物(63 mg)。

^1H NMR (CD_3OD): δ 8.01-6.62 (m, 6H), 5.85 並且 5.71 (two s, 1H) 3.54 並且 3.50 (two s, 3H), 2.26 並且 2.13 (two s, 3H)。

實例 9

3-溴-5-(2-氯-4-氟苯基)- α -(2,4-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-
 甲醇 (化合物 30) 的製備

步驟 A: 3,5-二溴-1*H*-吡唑的製備

於 3,4,5-三溴-1*H*-吡唑(10.0 g, 32.8 mmol)在四氫呋喃(130 mL)中之混合物中在 -70°C 在氬氛圍中在 20 分鐘期間加入正丁基鋰 (28.8 mL, 72.1 mmol, 2.5 M 在己烷中)。將反應混合物在 -70°C 攪拌 2 小時，而後將甲醇/四氫呋喃(20 mL/30 mL)以滴加方式加入。使反應混合物溫熱至室溫並在減壓下濃縮。將所得材料以二乙醚(500 mL)稀釋，以氫氯酸水溶液(1 N, 25 mL)與飽和氯化鈉水溶液(20 mL)洗滌，以硫酸鈉乾燥、過濾並在減壓下濃縮以提供呈黃色固體之標題化合物(6.20 g)。

^1H NMR ($\text{DMSO}-d_6$): δ 6.23 (s, 1H)。

步驟 B: 3,5-二溴-1-甲基-1*H*-吡唑的製備

於氫化鈉(2.74 g 60%在礦物油中, 68.6 mmol) 在四氫呋喃(40 mL)中之混合物中在 0°C 在 10 分鐘期間加入在四氫呋喃(25 mL)之 3,5-二溴-1*H*-吡唑 (即步驟 A 之產物) (6.20 g, 27.4 mmol)。將反應混合物在 0°C 攪拌

1 小時，而後將碘甲烷(3.42 mL, 54.9 mmol)以滴加方式加入。在 3 小時後使反應混合物溫熱至室溫、將飽和氯化銨水溶液(10 mL)加入並將所得混合物以乙酸乙酯(2×100 mL)萃取。將合併之有機層以飽和氯化鈉水溶液洗滌，以硫酸鎂乾燥、過濾並在減壓下濃縮以提供呈棕黃色固體之標題化合物(6.0 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 6.29 (s, 1H), 3.85 (s, 3H)。

步驟 C: 3-溴-5-(2-氯-4-氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑的製備

將 3,5-二溴-1-甲基-1*H*-吡唑 (即步驟 B 之產物) (2.00 g, 8.33 mmol) 在甲苯(40 mL)中之混合物以氫氣流鼓泡 45 分鐘，而後將 2-氯-4-氟苯硼酸(1.59 g, 9.11 mmol)、磷酸三鉀(5.30 g, 25.0 mmol)與肆(三苯基膦)鈹(0) (0.48 g, 0.41 mmol) 加入。將反應混合物在 90°C 加熱 3 小時，而後冷卻至室溫並以乙酸乙酯(250 mL)稀釋。將混合物以水(25 mL)與飽和氯化鈉水溶液洗滌，以硫酸鈉乾燥、過濾並在減壓下濃縮。使所得材料藉由矽膠管柱層析 (5 至 40% 梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 純化以提供標題化合物(620 mg)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.32-7.27 (m, 2H), 7.09 (m, 1H), 6.28 (s, 1H), 3.67 (s, 3H)。

步驟 D: 3-溴-5-(2-氯-4-氟苯基)-4-碘-1-甲基-1*H*-吡唑的製備

於 3-溴-5-(2-氯-4-氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑(即步驟 C 之產物)(620 mg, 2.14 mmol)在 *N,N*-二甲基甲醯胺(8 mL)中之混合物中[在 60°C 加入 *N*-碘琥珀醯亞胺(963 mg, 4.28 mmol)。將反應混合物在 60°C 攪拌 3 小時，而後以乙酸乙酯稀釋，以水與飽和氯化鈉水溶液洗滌，以硫酸鈉乾燥並在減壓下濃縮。將材料藉由矽膠管柱層析(5 至 30% 梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液)純化以提供呈淺黃色固體之標題化合物(515 mg)，其在 139 至 141°C 熔化。

¹H NMR (CDCl₃): δ 7.30 (m, 2H), 7.15 (m, 2H), 3.72 (s, 3H)。

步驟 E: 3-溴-5-(2-氯-4-氟苯基)-α-(2,4-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇的製備

於 3-溴-5-(2-氯-4-氟苯基)-4-碘-1-甲基-1*H*-吡唑(即步驟 D 之產物)(250 mg, 0.602 mmol)在四氫呋喃(3 mL)中之混合物中在 -78°C 以滴加方式加入正丁基鋰(2.5 M 在己烷中之溶液, 0.36 mL, 0.90 mmol)。在 -78 至 -40 °C 下持續攪拌 1 小時，而後將反應混合物冷卻至 -78°C 並將在四氫呋喃(2 mL)中之 2,4-二氟苯甲醛(103 mg, 0.72 mmol)以滴加方式加入。使反應混合物溫熱至室溫並攪拌 3 小時，而後將飽和氯化銨水溶液加入並將混合物以乙酸乙酯(2 × 20 mL)萃取。將合併之有機層以水與飽和氯化鈉水溶液洗滌，以硫酸鈉乾燥並在減壓下濃縮。將所得材料藉由矽膠管柱層析(10 至 50% 梯度之

在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液)純化以提供標題化合物，其為呈灰白色固體之本發明化合物(35 mg)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.22 (m, 2H), 6.87 (m, 1H), 6.77 (m, 1H), 6.63 (m, 2H), 5.90 (d, $J = 4.7$ Hz, 1H), 3.53 (s, 3H), 2.17 (d, $J = 4.7$ Hz, 1H)。

實例 10

4-(2-氯-4-氯苯甲醯基)-5-(2,6-二氯苯基)-1-甲基-1*H*-吡啶-3-甲腈 (化合物 52) 的製備

步驟 A: 5-(2,6-二氯苯基)-1-甲基-1*H*-吡啶-3-羧酸乙酯的製備

於 2,6-二氯苯乙酮(4.7 g, 0.03 mol)與乙二酸 1,2-二乙酯(4.8 g, 0.033 mol)在乙醇(33 mL)中之混合物中加入三級丁氧化鈉(3.17 g, 0.033 mol)。在 1 小時後，將更多乙醇(30 mL)加入至反應混合物並持續攪拌 1 小時。使反應混合物分配在氫氯酸(1 N)與二乙醚間。將有機相分離，以硫酸鎂乾燥、過濾並在減壓下濃縮至其原有體積之半。於所得混合物中加入甲腈(1.52 g, 0.033 mol)並持續攪拌整夜。在減壓下濃縮反應混合物並將所得材料藉由矽膠管柱層析(5 至 20%梯度之在二氯甲烷中的乙酸乙酯作為洗提液)純化，以提供呈固體之標題化合物(1.0 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.56-7.38 (m, 1H) 7.06 (m, 2H) 6.95 (s, 1H), 4.43 (d, 2H) 3.86 (s, 3H), 1.42 (t, 3H)。

步驟 B： 5-(2,6-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-3-甲腈的
製備

於氯化鋁(0.42 g, 7.52 mmol)在甲苯(10 mL)中之混合物中在 0°C 以滴加方式加入三甲基鋁(2 M 在甲苯中, 3.76 mL, 7.52 mmol)。在加入完成後, 將反應混合物在 0°C 攪拌 1 小時, 溫熱至室溫, 而後將 5-(2,6-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-3-羧酸乙酯(即步驟 A 之產物)(1 g, 3.76 mmol)在甲苯(5 mL)中之混合物加入並將混合物在 110°C 下加熱 4 小時。使反應混合物冷卻至室溫, 分配在氫氯酸水溶液(1 N)與二乙醚(約 20 mL)間並將有機相分離。將水相以二乙醚萃取並將合併之有機層以硫酸鎂乾燥、過濾並在減壓下濃縮。使所得材料藉由矽膠管柱層析(10 至 20%梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液)純化以提供呈固體之標題化合物(0.4 g)。

¹H NMR (CDCl₃): δ 7.61-7.41 (m, 1H), 7.08 (m, 2H), 6.80 (s, 1H), 3.85 (s, 3H)。

步驟 C： 4-(2-氯-4-氟苯甲醯基)-5-(2,6-二氟苯基)-1-
甲基-1*H*-吡唑-3-甲腈的製備

於氯化鋁(0.18 g, 1.36 mmol)在 1,2-二氯乙烷(2 mL)中之混合物中加入 2-氯-4-氟苯甲醯氯化物(0.26 g, 1.36 mmol)與 5-(2,6-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-3-甲腈(即步驟 B 之產物)(0.15 g, 0.68 mmol)在二氯乙烷(1 mL)中之混合物。將反應混合物在 180°C 在 Biotage Initiator™微波裝置中加熱 30 分鐘。將所得混合物直接倒入 Varian Bond Elute SI®管柱(以二氯甲烷接著以

30%之在己烷中的乙酸乙酯洗提) 以提供標題化合物，其為呈固體之本發明化合物(0.07 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 8.12-8.03 (m, 1H), 7.41-7.57 (m, 1H), 7.40-7.33 (m, 1H), 7.12-7.04 (m, 1H), 6.91-7.03 (m, 2H), 3.85 (s, 3H)。

實例 11

4-[(2-氯-4-氟苯基)羥甲基]-5-(2,6-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-3-甲腈 (化合物 53) 的製備

於 4-(2-氯-4-氟苯甲醯基)-5-(2,6-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-3-甲腈 (即實例 10) (0.05 g, 0.13 mmol) 在乙醇 (2 mL) 中之混合物中加入硼氫化鈉 (0.005 g, 0.13 mmol)。將反應攪拌 30 分鐘，而後將氫氯酸 (1 N) (0.5 mL) 加入並將混合物在減壓下濃縮。將所得材料以二氯甲烷 (5 mL) 稀釋並經過 Celite® (矽藻土) 萃取管 (以二氯甲烷 (15 mL) 潤洗) 過濾。在減壓下濃縮濾液並使所得材料藉由快速層析在矽膠，Varian Bond Elute SI® 管柱 (10 至 50% 梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 上純化以提供標題化合物，其為呈固體之本發明化合物 (0.03 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.63-7.54 (m, 1H), 7.53-7.40 (m, 1H), 7.06-6.91 (m, 3H), 6.90-6.81 (m, 1H), 6.01 (d, 1H), 3.73 (s, 3H), 2.51 (d, 1H)。

實例 12

5-(2,6-二氟苯基)- α -(4-氟-2-甲基苯基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇 (化合物 157) 的製備

步驟 A: 3-(2,6-二氟苯基)-2-丙炔酸甲酯的製備

於(重氮甲基)三甲矽烷 (2.0 M 在己烷中, 25 mL, 50 mmol) 在四氫呋喃(100 mL)中之混合物中在 -78°C 在 5 分鐘期間加入正丁基鋰 (2.5 M 在己烷中, 20 mL, 50 mmol)。在加入完成後, 將反應混合物溫度在約 -78°C 維持 30 分鐘而後將 2,6-二氟苯甲醛(7.1 g, 50 mmol)分成數份加入。將反應混合物在 -78°C 下維持額外 30 分鐘而後使其溫熱至室溫, 在此期間發生氣體逸出。將反應混合物再度冷卻至 -78°C 並將正丁基鋰 (2.5 M 在己烷中, 28 mL, 70 mmol) 在 5 分鐘期間加入。在 15 分鐘後在 -78°C , 將氯甲酸甲酯(7.8 mL, 100 mmol)加入至反應混合物。在 30 分鐘, 使反應混合物溫熱至 0°C , 而後分配在二乙醚與飽和氯化銨溶液間。將有機相分離, 以硫酸鎂乾燥、過濾並在減壓下濃縮。使所得材料藉由矽膠管柱層析 (0 至 100%梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 純化以提供標題化合物(8.0 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.48-7.33 (m, 1H), 7.06-6.81 (m, 2H), 3.87 (s, 3H)。

步驟 B: 5-(2,6-二氟苯基)-1,2-二氫-1-甲基-3*H*-吡唑-3-酮的製備

將 3-(2,6-二氟苯基)-2-丙炔酸甲酯(5.0 g, 25.5 mmol) (即步驟 A 之產物) 與甲胼(1.6 mL, 30.6 mmol) 在乙醇/水 (25 mL, 1:1 混合物) 溶液中之混合物在 70°C 加熱整夜。在減壓下濃縮反應混合物並將所得材料藉由矽膠管柱層析 (90% 之在乙酸乙酯中己烷的作為洗提液) 純化, 以提供標題化合物(2.5 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 11.85 (br s, 1H), 7.51-7.32 (m, 1H), 7.08-6.95 (m, 2H), 5.79 (s, 1H), 3.61 (s, 3H)。

步驟 C: 5-(2,6-二氟苯基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑的製備

將 5-(2,6-二氟苯基)-1,2-二氫-1-甲基-3*H*-吡唑-3-酮(2.0 g, 9.6 mmol) (步驟 B 之產物)、碳酸鉀(1.9 g, 14 mmol) 與碘甲烷(0.75 mL, 12 mmol) 在乙腈(20 mL) 中之混合物在 70°C 加熱 4 小時而後使其冷卻至室溫。在約 48 小時後, 將反應以二氯甲烷稀釋並使所得混合物經過 Celite® (矽藻土) 墊過濾並且在減壓下濃縮濾液。使所得材料藉由矽膠管柱層析 (0 至 100% 梯度之在己烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 純化以提供標題化合物(1.3 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 7.48-7.34 (m, 1H), 7.09-6.93 (m, 2H), 5.79 (s, 1H), 3.92 (s, 3H), 3.62 (s, 3H)。

步驟 D: 5-(2,6-二氟苯基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑-4-羧醛的製備

於 5-(2,6-二氟苯基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑(0.5 g, 2.2 mmol) (即步驟 C 之產物) 在 *N,N*-二甲基甲醯胺 (5 mL) 中之混合物中在 80°C 加入磷醯氯(0.31 mL, 3.3 mmol)。在 2 小時後使反應混合物冷卻至室溫並以氫氧化鈉 (1 N, 約 5 mL) 與水稀釋。將所得混合物以二乙醚(2x)萃取並將合併之有機層以水洗滌，以硫酸鎂乾燥、過濾並在減壓下濃縮。使所得材料藉由矽膠管柱層析 (0 至 100% 梯度之在二氯甲烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 純化以提供標題化合物(0.5 g)。

¹H NMR (CDCl₃): δ 9.65 (s, 1H), 7.59-7.44 (m, 1H), 7.12-7.02 (m, 2H), 4.05 (s, 3H), 3.63 (s, 3H)。

步驟 E: 5-(2,6-二氟苯基)-α-(4-氟-2-甲基苯基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇的製備

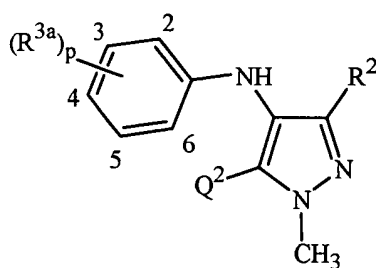
於 5-(2,6-二氟苯基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醛(0.25 g, 0.99 mmol) (即步驟 D 之產物) 在四氫呋喃(5 mL)中之混合物中在 -30°C 加入 4-氟-2-甲基苯基溴化鎂 (0.5 M 在己烷中, 2.0 mL, 1.0 mmol)。使反應混合物溫熱至 0°C, 以飽和氯化銨溶液淬熄並在減壓下濃縮。將所得材料以二氯甲烷與水稀釋, 倒入固相萃尿管 (Varian Chem Elute®, 以矽藻土預填充) 並以二氯甲烷洗提。在減壓下濃縮二氯甲烷洗提液並將所得材料藉由矽膠管柱層析 (0 至 100% 梯度之在二氯甲烷中的乙酸乙酯作為洗提液) 純化, 以提供標題化合物(0.3 g)。

¹H NMR (CDCl₃): δ 7.40-7.20 (m, 2H), 6.93-6.80 (m, 1H), 6.80-6.68 (m, 1H), 6.67-6.58 (m, 1H), 6.58-6.48 (m,

1H), 5.87-5.75 (m, 1H), 4.01 (s, 3H), 3.47 (s, 3H), 2.50-2.37 (m, 1H), 2.05 (s, 3H)。

藉由本文中所述製程連同該技術領域中習知的方法，可製備出下表中揭露的化合物。下列縮寫係用於表中如下：Me 代表甲基，Et 代表乙基，*n*-Pr 代表正丙基，*c*-Pr 代表環丙基，Ph 代表苯基，MeO 代表甲氧基，EtO 代表乙氧基，-CN 代表氰基並且-NO₂ 代表硝基。

表 1



Q² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R² 為 Me。

(R ^{3a}) _p	(R ^{3a}) _p	(R ^{3a}) _p	(R ^{3a}) _p	(R ^{3a}) _p
2-F	2,4-二-Me	2-Cl、4-MeO	4-Br、2,6-二-F	4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
3-F	2-F、4-Cl	2-F、4-MeO	2,4-二-Br、6-F	4-MeO(CH ₂) ₃ O
4-F	2-Cl、4-F	2-Cl、4-EtO	2-Br、4-Cl、6-F	2-F、
				4-MeNH(CH ₂) ₃ O
2-Cl	2-F、4-Br	2-F、4-EtO	2-I、4,6-二-F	2-F、
				4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
3-Cl	2-Cl、4-Br	2,4,5-三-F	4-I、2,6-二-F	2-Cl、
				4-MeO(CH ₂) ₃ O
4-Cl	2-Br、4-Cl	2,3,5-三-F	2,6-二-Cl、4-CN	2,6-二-F、
				4-MeNH(CH ₂) ₃ O
2-Br	2-Br、4-F	2,3,6-三-F	2,6-二-F、4-CN	2,6-二-F、
				4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
3-Br	2-I、4-F	2,4,6-三-F	2,6-二-Cl、4-MeO	2,6-二-F、
				4-MeO(CH ₂) ₃ O
4-Br	2-Me、4-F	2,4,6-三-Cl	2,6-二-F、4-MeO	2,6-二-F、

4-Me	2-Cl、4-CN	2-Cl、4,6-二-F	2,6-二-Cl、4-EtO	3-MeNH(CH ₂) ₃ O 2,6-二-F、
2,6-二-F	2-F、4-CN	2,6-二-Cl、4-F	2,6-二-F、4-EtO	3-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O 2,6-二-F、
2,4-二-F	2-Br、4-CN	2,4-二-Cl、6-F	2-Br、4-F、6-Cl	3-MeO(CH ₂) ₃ O 2-Cl-6-F、
2,4-二-Cl	2-CF ₃ 、4-F	4-Cl、2,6-二-F	2-Cl、4-Br、6-F	4-MeNH(CH ₂) ₃ O 2-Cl-6-F、
2,6-二-Cl	2-Br、4-MeO	2-Br、4,6-二-F	4-MeNH(CH ₂) ₃ O	4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O 2-Cl-6-F、
				4-MeO(CH ₂) ₃ O

本揭露亦包含表 1A 至 164A，各表架構除了表 1 中列標題（即「Q² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R² 為 Me。」）係以下面分別所列之列標題代替之外，其餘皆與上面表 1 相同。例如，在表 1A 中該列標題「Q² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R² 為 Cl」，並且(R³)_p 係定義如上表 1 中者。因此，表 1A 中第一項具體揭露 3-氯-5-(2,6-二氟苯基)-N-(2-氟苯基)-1-甲基-1H-吡唑-4-胺。表 2A 至 164A 係以類似的方式建構。

表	列標題	表	列標題
1A	Q ² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R ² 為 Cl。	83A	Q ² 為 2-Br-Ph 並且 R ² 為 Et。
2A	Q ² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R ² 為 Br。	84A	Q ² 為 2-Br-Ph 並且 R ² 為 CN。
3A	Q ² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R ² 為 Et。	85A	Q ² 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R ² 為 Me。
4A	Q ² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R ² 為 CN。	86A	Q ² 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R ² 為 Cl。
5A	Q ² 為 2,4-二-F-Ph 並且 R ² 為 Me。	87A	Q ² 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R ² 為 Br。
6A	Q ² 為 2,4-二-F-Ph 並且 R ² 為 Cl。	88A	Q ² 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R ² 為 Et。
7A	Q ² 為 2,4-二-F-Ph 並且 R ² 為 Br。	89A	Q ² 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R ² 為 CN。
8A	Q ² 為 2,4-二-F-Ph 並且 R ² 為 Et。	90A	Q ² 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R ² 為 Me。

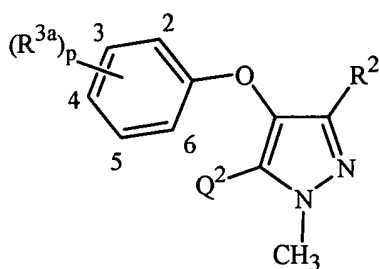
表	列標題	表	列標題
9A	Q^2 為 2,4-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	91A	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。
10A	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	92A	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。
11A	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	93A	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。
12A	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	94A	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。
13A	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	95A	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Me。
14A	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	96A	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。
15A	Q^2 為 2,6-二-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。	97A	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。
16A	Q^2 為 2,6-二-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。	98A	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。
17A	Q^2 為 2,6-二-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。	99A	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。
18A	Q^2 為 2,6-二-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。	100A	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。
19A	Q^2 為 2,6-二-F-4-Me-Ph 並且 R^2 為 CN。	101A	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
20A	Q^2 為 2,6-二-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。	102A	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。
21A	Q^2 為 2,6-二-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Cl。	103A	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。
22A	Q^2 為 2,6-二-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Br。	104A	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 CN。
23A	Q^2 為 2,6-二-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。	105A	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。
24A	Q^2 為 2,6-二-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。	106A	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
25A	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。	107A	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Br。
26A	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。	108A	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。
27A	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。	109A	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。
28A	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。	110A	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。
29A	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。	111A	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。

表	列標題	表	列標題
30A	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	112A	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。
31A	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	113A	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。
32A	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	114A	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 CN。
33A	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	115A	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。
34A	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	116A	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
35A	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	117A	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Br。
36A	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	118A	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。
37A	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	119A	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。
38A	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	120A	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。
39A	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	121A	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
40A	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	122A	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。
41A	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	123A	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。
42A	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	124A	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 CN。
43A	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	125A	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。
44A	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	126A	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
45A	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	127A	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Br。
46A	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	128A	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。
47A	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	129A	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。
48A	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	130A	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。
49A	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	131A	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。
50A	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	132A	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。

表	列標題	表	列標題
51A	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	133A	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。
52A	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	134a	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。
53A	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	135A	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。
54A	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	136A	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。
55A	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	137A	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。
56A	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	138A	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。
57A	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	139A	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。
58A	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	140A	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。
59A	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	141A	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。
60A	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	142A	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。
61A	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	143A	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。
62A	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	144A	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。
63A	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	145A	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Me。
64A	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	146A	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Cl。
65A	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	147A	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Br。
66A	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	148A	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Et。
67A	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	149A	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 CN。
68A	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	150A	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Me。
69A	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	151A	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Cl。
70A	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	152A	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Br。
71A	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	153A	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Et。

表	列標題	表	列標題
72A	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	154A	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 CN。
73A	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	155A	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Me。
74A	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	156A	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Cl。
75A	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Me。	157A	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Br。
76A	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。	158A	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Et。
77A	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。	159A	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 CN。
78A	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。	160A	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Me。
79A	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。	161A	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Cl。
80A	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Me。	162A	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Br。
81A	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Cl。	163A	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Et。
82A	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Br。	164A	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 CN。

表 2



Q^2 為 2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。

$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$
2-F	2,4-二-Me	2-Cl、4-MeO	4-Br、2,6-二-F	4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
3-F	2-F、4-Cl	2-F、4-MeO	2,4-二-Br、6-F	4-MeO(CH ₂) ₃ O
4-F	2-Cl、4-F	2-Cl、4-EtO	2-Br、4-Cl、6-F	2-F、 4-MeNH(CH ₂) ₃ O

2-Cl	2-F、4-Br	2-F、4-EtO	2-I、4,6-二-F	2-F、 4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
3-Cl	2-Cl、4-Br	2,4,5-三-F	4-I、2,6-二-F	2-Cl、 4-MeO(CH ₂) ₃ O
4-Cl	2-Br、4-Cl	2,3,5-三-F	2,6-二-Cl、4-CN	2,6-二-F、 4-MeNH(CH ₂) ₃ O
2-Br	2-Br、4-F	2,3,6-三-F	2,6-二-F、4-CN	2,6-二-F、 4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
3-Br	2-I、4-F	2,4,6-三-F	2,6-二-Cl、4-MeO	2,6-二-F、 4-MeO(CH ₂) ₃ O
4-Br	2-Me、4-F	2,4,6-三-Cl	2,6-二-F、4-MeO	2,6-二-F、 3-MeNH(CH ₂) ₃ O
4-Me	2-Cl、4-CN	2-Cl、4,6-二-F	2,6-二-Cl、4-EtO	2,6-二-F、 3-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
2,6-二-F	2-F、4-CN	2,6-二-Cl、4-F	2,6-二-F、4-EtO	2,6-二-F、 3-MeO(CH ₂) ₃ O
2,4-二-F	2-Br、4-CN	2,4-二-Cl、6-F	2-Br、4-F、6-Cl	2-Cl-6-F、 4-MeNH(CH ₂) ₃ O
2,4-二-Cl	2-CF ₃ 、4-F	4-Cl、2,6-二-F	2-Cl、4-Br、6-F	2-Cl-6-F、 4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
2,6-二-Cl	2-Br、4-MeO	2-Br、4,6-二-F	4-MeNH(CH ₂) ₃ O	2-Cl-6-F、 4-MeO(CH ₂) ₃ O

本揭露亦包含表 1B 至 164B，各表架構除了表 2 中列標題（即「Q² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R² 為 Me。」）係以下面分別所列之列標題代替之外，其餘皆與上面表 2 相同。例如，在表 1B 中該列標題「Q² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R² 為 Cl」，並且(R³)_p 係定義如上表 2 中者。因此，表 1B 中第一項具體揭露 3-氯-5-(2,6-二氟苯基)-4-(2-氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑。表 2B 至 164B 係以類似的方式建構。

表	列標題	表	列標題
1B	Q ² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R ² 為 Cl。	83B	Q ² 為 2-Br-Ph 並且 R ² 為 Et。
2B	Q ² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R ² 為 Br。	84B	Q ² 為 2-Br-Ph 並且 R ² 為 CN。
3B	Q ² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R ² 為 Et。	85B	Q ² 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R ² 為

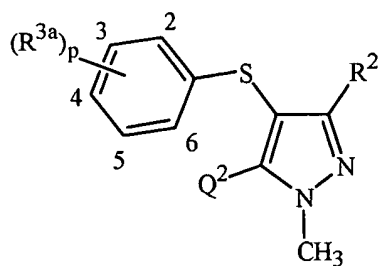
表	列標題	表	列標題
4B	Q^2 為 2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	86B	Me。 Q^2 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。
5B	Q^2 為 2,4-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	87B	Q^2 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。
6B	Q^2 為 2,4-二-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	88B	Q^2 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。
7B	Q^2 為 2,4-二-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	89B	Q^2 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。
8B	Q^2 為 2,4-二-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	90B	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Me。
9B	Q^2 為 2,4-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	91B	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。
10B	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	92B	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。
11B	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	93B	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。
12B	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	94B	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。
13B	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	95B	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Me。
14B	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	96B	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。
15B	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Me。	97B	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。
16B	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Cl。	98B	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。
17B	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Br。	99B	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。
18B	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Et。	100B	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。
19B	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 CN。	101B	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
20B	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Me。	102B	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。
21B	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Cl。	103B	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。
22B	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Br。	104B	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 CN。
23B	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Et。	105B	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。
24B	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且	106B	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為

表	列標題	表	列標題
	R^2 為 CN。		Cl。
25B	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。	107B	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Br。
26B	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。	108B	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。
27B	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。	109B	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。
28B	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。	110B	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。
29B	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。	111B	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
30B	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	112B	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。
31B	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	113B	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。
32B	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	114B	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 CN。
33B	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	115B	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。
34B	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	116B	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
35B	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	117B	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Br。
36B	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	118B	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。
37B	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	119B	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。
38B	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	120B	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。
39B	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	121B	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
40B	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	122B	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。
41B	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	123B	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。
42B	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	124B	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 CN。
43B	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	125B	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。
44B	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	126B	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
45B	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2	127B	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為

表	列標題	表	列標題
	為 Me。		Br。
46B	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	128B	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。
47B	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	129B	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。
48B	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	130B	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。
49B	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	131B	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。
50B	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	132B	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。
51B	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	133B	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。
52B	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	134B	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。
53B	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	135B	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。
54B	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	136B	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。
55B	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	137B	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。
56B	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	138B	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。
57B	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	139B	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。
58B	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	140B	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。
59B	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	141B	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。
60B	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	142B	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。
61B	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	143B	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。
62B	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	144B	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。
63B	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	145B	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Me。
64B	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	146B	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Cl。
65B	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	147B	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Br。
66B	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	148B	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為

表	列標題	表	列標題
67B	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	149B	Et。
68B	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	150B	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基，並且 R^2 為 CN。
69B	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	151B	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Me。
70B	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	152B	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Cl。
71B	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	153B	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Br。
72B	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	154B	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Et。
73B	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	155B	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 CN。
74B	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	156B	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Me。
75B	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Me。	157B	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Cl。
76B	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。	158B	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Br。
77B	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。	159B	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Et。
78B	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。	160B	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 CN。
79B	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。	161B	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Me。
80B	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Me。	162B	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Cl。
81B	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Cl。	163B	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基，並且 R^2 為 Br。
82B	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Br。	164B	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Et。
			Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 CN。

表 3



Q^2 為 2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。

$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$
2-F	2,4-二-Me	2-Cl、4-MeO	4-Br、2,6-二-F	4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
3-F	2-F、4-Cl	2-F、4-MeO	2,4-二-Br、6-F	4-MeO(CH ₂) ₃ O
4-F	2-Cl、4-F	2-Cl、4-EtO	2-Br、4-Cl、6-F	2-F、
				4-MeNH(CH ₂) ₃ O
2-Cl	2-F、4-Br	2-F、4-EtO	2-I、4,6-二-F	2-F、
				4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
3-Cl	2-Cl、4-Br	2,4,5-三-F	4-I、2,6-二-F	2-Cl、
				4-MeO(CH ₂) ₃ O
4-Cl	2-Br、4-Cl	2,3,5-三-F	2,6-二-Cl、4-CN	2,6-二-F、
				4-MeNH(CH ₂) ₃ O
2-Br	2-Br、4-F	2,3,6-三-F	2,6-二-F、4-CN	2,6-二-F、
				4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
3-Br	2-I、4-F	2,4,6-三-F	2,6-二-Cl、4-MeO	2,6-二-F、
				4-MeO(CH ₂) ₃ O
4-Br	2-Me、4-F	2,4,6-三-Cl	2,6-二-F、4-MeO	2,6-二-F、
				3-MeNH(CH ₂) ₃ O
4-Me	2-Cl、4-CN	2-Cl、4,6-二-F	2,6-二-Cl、4-EtO	2,6-二-F、
				3-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
2,6-二-F	2-F、4-CN	2,6-二-Cl、4-F	2,6-二-F、4-EtO	2,6-二-F、
				3-MeO(CH ₂) ₃ O
2,4-二-F	2-Br、4-CN	2,4-二-Cl、6-F	2-Br、4-F、6-Cl	2-Cl-6-F、
				4-MeNH(CH ₂) ₃ O
2,4-二-Cl	2-CF ₃ 、4-F	4-Cl、2,6-二-F	2-Cl、4-Br、6-F	2-Cl-6-F、
				4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
2,6-二-Cl	2-Br、4-MeO	2-Br、4,6-二-F	4-MeNH(CH ₂) ₃ O	2-Cl-6-F、
				4-MeO(CH ₂) ₃ O

本揭露亦包含表 1C 至 164C，各表架構除了表 3 中列標題（即「 Q^2 為 2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。」）係以下面分別所列之列標題代替之外，其餘皆與上面表 3 相

同。例如，在表 1C 中該列標題「 Q^2 為 2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Cl」，並且 $(R^3)_p$ 係定義如上表 3 中者。因此，表 1C 中第一項具體揭露 3-氯-5-(2,6-二氟苯基)-4-[(2-氟苯基)硫基]-1-甲基-1*H*-吡唑。表 2C 至 164C 係以類似的方式建構。

表	列標題	表	列標題
1C	Q^2 為 2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	83C	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Et。
2C	Q^2 為 2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	84C	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 CN。
3C	Q^2 為 2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	85C	Q^2 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R^2 為 Me。
4C	Q^2 為 2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	86C	Q^2 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。
5C	Q^2 為 2,4-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	87C	Q^2 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。
6C	Q^2 為 2,4-二-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	88C	Q^2 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。
7C	Q^2 為 2,4-二-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	89C	Q^2 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。
8C	Q^2 為 2,4-二-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	90C	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Me。
9C	Q^2 為 2,4-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	91C	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。
10C	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	92C	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。
11C	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	93C	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。
12C	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	94C	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。
13C	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	95C	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Me。
14C	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	96C	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。
15C	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Me。	97C	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。
16C	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Cl。	98C	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。

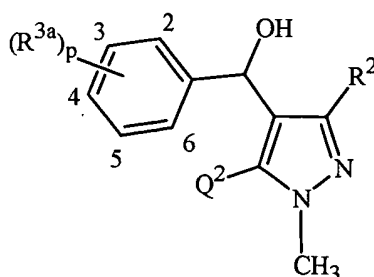
表	列標題	表	列標題
17C	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Br。	99C	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。
18C	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Et。	100C	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。
19C	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 CN。	101C	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
20C	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Me。	102C	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。
21C	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Cl。	103C	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。
22C	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Br。	104C	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 CN。
23C	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Et。	105C	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。
24C	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 CN。	106C	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
25C	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。	107C	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Br。
26C	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。	108C	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。
27C	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。	109C	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。
28C	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。	110C	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。
29C	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。	111C	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
30C	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	112C	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。
31C	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	113C	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。
32C	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	114C	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 CN。
33C	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	115C	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。
34C	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	116C	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
35C	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	117C	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Br。
36C	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	118C	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。
37C	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	119C	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。

表	列標題	表	列標題
38C	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	120C	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。
39C	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	121C	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
40C	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	122C	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。
41C	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	123C	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。
42C	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	124C	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 CN。
43C	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	125C	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。
44C	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	126C	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
45C	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	127C	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Br。
46C	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	128C	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。
47C	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	129C	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。
48C	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	130C	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。
49C	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	131C	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。
50C	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	132C	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。
51C	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	133C	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。
52C	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	134C	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。
53C	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	135C	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。
54C	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	136C	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。
55C	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	137C	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。
56C	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	138C	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。
57C	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	139C	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。
58C	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	140C	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。

表	列標題	表	列標題
59C	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	141C	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。
60C	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	142C	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。
61C	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	143C	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。
62C	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	144C	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。
63C	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	145C	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Me。
64C	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	146C	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Cl。
65C	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	147C	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Br。
66C	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	148C	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Et。
67C	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	149C	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 CN。
68C	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	150C	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Me。
69C	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	151C	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Cl。
70C	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	152C	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Br。
71C	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	153C	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Et。
72C	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	154C	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 CN。
73C	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	155C	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Me。
74C	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	156C	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Cl。
75C	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Me。	157C	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Br。
76C	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。	158C	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Et。
77C	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。	159C	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 CN。
78C	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。	160C	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Me。
79C	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。	161C	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Cl。

表	列標題	表	列標題
80C	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Me。	162C	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Br。
81C	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Cl。	163C	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Et。
82C	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Br。	164C	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 CN。

表 4



Q^2 為 2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。

$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$
2-F	2,4-二-Me	2-Cl、4-MeO	4-Br、2,6-二-F	4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
3-F	2-F、4-Cl	2-F、4-MeO	2,4-二-Br、6-F	4-MeO(CH ₂) ₃ O
4-F	2-Cl、4-F	2-Cl、4-EtO	2-Br、4-Cl、6-F	2-F、
				4-MeNH(CH ₂) ₃ O
2-Cl	2-F、4-Br	2-F、4-EtO	2-I、4,6-二-F	2-F、
				4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
3-Cl	2-Cl、4-Br	2,4,5-三-F	4-I、2,6-二-F	2-Cl、
				4-MeO(CH ₂) ₃ O
4-Cl	2-Br、4-Cl	2,3,5-三-F	2,6-二-Cl、4-CN	2,6-二-F、
				4-MeNH(CH ₂) ₃ O
2-Br	2-Br、4-F	2,3,6-三-F	2,6-二-F、4-CN	2,6-二-F、
				4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
3-Br	2-I、4-F	2,4,6-三-F	2,6-二-Cl、4-MeO	2,6-二-F、
				4-MeO(CH ₂) ₃ O
4-Br	2-Me、4-F	2,4,6-三-Cl	2,6-二-F、4-MeO	2,6-二-F、
				3-MeNH(CH ₂) ₃ O
4-Me	2-Cl、4-CN	2-Cl、4,6-二-F	2,6-二-Cl、4-EtO	2,6-二-F、
				3-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
2,6-二-F	2-F、4-CN	2,6-二-Cl、4-F	2,6-二-F、4-EtO	2,6-二-F、
				3-MeO(CH ₂) ₃ O

2,4-二-F	2-Br、4-CN	2,4-二-Cl、6-F	2-Br、4-F、6-Cl	2-Cl-6-F、 4-MeNH(CH ₂) ₃ O
2,4-二-Cl	2-CF ₃ 、4-F	4-Cl、2,6-二-F	2-Cl、4-Br、6-F	2-Cl-6-F、 4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
2,6-二-Cl	2-Br、4-MeO	2-Br、4,6-二-F	4-MeNH(CH ₂) ₃ O	2-Cl-6-F、 4-MeO(CH ₂) ₃ O

本揭露亦包含表 1D 至 164D，各表架構除了表 4 中列標題（即「Q² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R² 為 Me。」）係以下面分別所列之列標題代替之外，其餘皆與上面表 4 相同。例如，在表 1D 中該列標題「Q² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R² 為 Cl」，並且(R³)_p 係定義如上表 4 中者。表 1D 中第一項具體揭露 3-氯-5-(2,6-二氟苯基)- α -(2-氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇。表 2D 至 164D 係以類似的方式建構。

表	列標題	表	列標題
1D	Q ² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R ² 為 Cl。	83D	Q ² 為 2-Br-Ph 並且 R ² 為 Et。
2D	Q ² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R ² 為 Br。	84D	Q ² 為 2-Br-Ph 並且 R ² 為 CN。
3D	Q ² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R ² 為 Et。	85D	Q ² 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R ² 為 Me。
4D	Q ² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R ² 為 CN。	86D	Q ² 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R ² 為 Cl。
5D	Q ² 為 2,4-二-F-Ph 並且 R ² 為 Me。	87D	Q ² 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R ² 為 Br。
6D	Q ² 為 2,4-二-F-Ph 並且 R ² 為 Cl。	88D	Q ² 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R ² 為 Et。
7D	Q ² 為 2,4-二-F-Ph 並且 R ² 為 Br。	89D	Q ² 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R ² 為 CN。
8D	Q ² 為 2,4-二-F-Ph 並且 R ² 為 Et。	90D	Q ² 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R ² 為 Me。
9D	Q ² 為 2,4-二-F-Ph 並且 R ² 為 CN。	91D	Q ² 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R ² 為 Cl。
10D	Q ² 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R ² 為 Me。	92D	Q ² 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R ² 為 Br。
11D	Q ² 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R ² 為 Cl。	93D	Q ² 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R ² 為 Et。

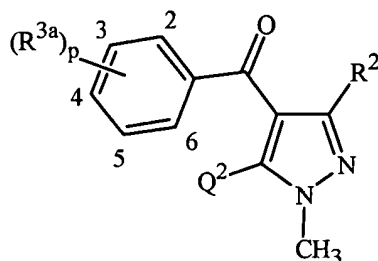
表	列標題	表	列標題
12D	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	94D	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。
13D	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	95D	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Me。
14D	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	96D	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。
15D	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Me。	97D	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。
16D	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Cl。	98D	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。
17D	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Br。	99D	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。
18D	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Et。	100D	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。
19D	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 CN。	101D	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
20D	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Me。	102D	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。
21D	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Cl。	103D	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。
22D	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Br。	104D	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 CN。
23D	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Et。	105D	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。
24D	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 CN。	106D	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
25D	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。	107D	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Br。
26D	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。	108D	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。
27D	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。	109D	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。
28D	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。	110D	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。
29D	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。	111D	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
30D	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	112D	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。
31D	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	113D	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。
32D	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	114D	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 CN。

表	列標題	表	列標題
33D	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	115D	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。
34D	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	116D	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
35D	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	117D	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Br。
36D	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	118D	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。
37D	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	119D	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。
38D	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	120D	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。
39D	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	121D	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
40D	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	122D	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。
41D	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	123D	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。
42D	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	124D	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 CN。
43D	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	125D	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。
44D	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	126D	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
45D	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	127D	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Br。
46D	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	128D	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。
47D	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	129D	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。
48D	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	130D	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。
49D	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	131D	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。
50D	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	132D	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。
51D	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	133D	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。
52D	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	134D	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。
53D	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	135D	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。

表	列標題	表	列標題
54D	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	136D	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。
55D	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	137D	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。
56D	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	138D	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。
57D	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	139D	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。
58D	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	140D	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。
59D	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	141D	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。
60D	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	142D	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。
61D	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	143D	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。
62D	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	144D	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。
63D	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	145D	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Me。
64D	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	146D	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Cl。
65D	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	147D	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Br。
66D	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	148D	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Et。
67D	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	149D	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 CN。
68D	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	150D	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Me。
69D	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	151D	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Cl。
70D	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	152D	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Br。
71D	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	153D	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Et。
72D	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	154D	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 CN。
73D	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	155D	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Me。
74D	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	156D	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Cl。

表	列標題	表	列標題
75D	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Me。	157D	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Br。
76D	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。	158D	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Et。
77D	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。	159D	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 CN。
78D	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。	160D	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Me。
79D	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN	161D	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Cl。
80D	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Me。	162D	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Br。
81D	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Cl。	163D	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Et。
82D	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Br。	164D	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 CN。

表 5



Q^2 為 2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。

$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$	$(R^{3a})_p$
2-F	2,4-二-Me	2-Cl、4-MeO	4-Br、2,6-二-F	4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
3-F	2-F、4-Cl	2-F、4-MeO	2,4-二-Br、6-F	4-MeO(CH ₂) ₃ O
4-F	2-Cl、4-F	2-Cl、4-EtO	2-Br、4-Cl、6-F	2-F、
				4-MeNH(CH ₂) ₃ O
2-Cl	2-F、4-Br	2-F、4-EtO	2-I、4,6-二-F	2-F、
				4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
3-Cl	2-Cl、4-Br	2,4,5-三-F	4-I、2,6-二-F	2-Cl、
				4-MeO(CH ₂) ₃ O
4-Cl	2-Br、4-Cl	2,3,5-三-F	2,6-二-Cl、4-CN	2,6-二-F、
				4-MeNH(CH ₂) ₃ O

2-Br	2-Br、4-F	2,3,6-三-F	2,6-二-F、4-CN	2,6-二-F、 4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
3-Br	2-I、4-F	2,4,6-三-F	2,6-二-Cl、4-MeO	2,6-二-F、 4-MeO(CH ₂) ₃ O
4-Br	2-Me、4-F	2,4,6-三-Cl	2,6-二-F、4-MeO	2,6-二-F、 3-MeNH(CH ₂) ₃ O
4-Me	2-Cl、4-CN	2-Cl、4,6-二-F	2,6-二-Cl、4-EtO	2,6-二-F、 3-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
2,6-二-F	2-F、4-CN	2,6-二-Cl、4-F	2,6-二-F、4-EtO	2,6-二-F、 3-MeO(CH ₂) ₃ O
2,4-二-F	2-Br、4-CN	2,4-二-Cl、6-F	2-Br、4-F、6-Cl	2-Cl-6-F、 4-MeNH(CH ₂) ₃ O
2,4-二-Cl	2-CF ₃ 、4-F	4-Cl、2,6-二-F	2-Cl、4-Br、6-F	2-Cl-6-F、 4-Me ₂ N(CH ₂) ₃ O
2,6-二-Cl	2-Br、4-MeO	2-Br、4,6-二-F	4-MeNH(CH ₂) ₃ O	2-Cl-6-F、 4-MeO(CH ₂) ₃ O

本揭露亦包含表 1E 至 164E，各表架構除了表 5 中列標題（即「Q² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R² 為 Me。」）係以下面分別所列之列標題代替之外，其餘皆與上面表 5 相同。例如，在表 1E 中該列標題「Q² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R² 為 Cl」，並且(R³)_p 係定義如上表 5 中者。表 1E 中第一項具體揭露(3-氯-5-(2,6-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡啶-4-基](2-氟苯基)甲醇。表 2E 至 164E 係以類似的方式建構。

表	列標題	表	列標題
1E	Q ² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R ² 為 Cl。	83E	Q ² 為 2-Br-Ph 並且 R ² 為 Et。
2E	Q ² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R ² 為 Br。	84E	Q ² 為 2-Br-Ph 並且 R ² 為 CN。
3E	Q ² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R ² 為 Et。	85E	Q ² 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R ² 為 Me。
4E	Q ² 為 2,6-二-F-Ph 並且 R ² 為 CN。	86E	Q ² 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R ² 為 Cl。
5E	Q ² 為 2,4-二-F-Ph 並且 R ² 為 Me。	87E	Q ² 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R ² 為 Br。
6E	Q ² 為 2,4-二-F-Ph 並且 R ² 為 Cl。	88E	Q ² 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R ² 為 Et。

表	列標題	表	列標題
7E	Q^2 為 2,4-二-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	89E	Q^2 為 2-F-4-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。
8E	Q^2 為 2,4-二-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	90E	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Me。
9E	Q^2 為 2,4-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	91E	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。
10E	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	92E	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。
11E	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	93E	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。
12E	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	94E	Q^2 為 2,4-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。
13E	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	95E	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Me。
14E	Q^2 為 2,4,6-三-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	96E	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。
15E	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Me。	97E	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。
16E	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Cl。	98E	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。
17E	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Br。	99E	Q^2 為 2,6-二-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。
18E	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 Et。	100E	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。
19E	Q^2 為 2,6-二-F-4-OMe-Ph 並且 R^2 為 CN。	101E	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
20E	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Me。	102E	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。
21E	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Cl。	103E	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。
22E	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Br。	104E	Q^2 為 2-F-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 CN。
23E	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 Et。	105E	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。
24E	Q^2 為 2,6-二-F-4-OEt-Ph 並且 R^2 為 CN。	106E	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
25E	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。	107E	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Br。
26E	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。	108E	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。
27E	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。	109E	Q^2 為 2-F-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。

表	列標題	表	列標題
28E	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。	110E	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。
29E	Q^2 為 2,6-二-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。	111E	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
30E	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	112E	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。
31E	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	113E	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。
32E	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	114E	Q^2 為 2-Cl-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 CN。
33E	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	115E	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。
34E	Q^2 為 2-Cl-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	116E	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
35E	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	117E	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Br。
36E	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	118E	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。
37E	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	119E	Q^2 為 2-Cl-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。
38E	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	120E	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Me。
39E	Q^2 為 2-Cl-6-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	121E	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
40E	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	122E	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Br。
41E	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	123E	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 Et。
42E	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	124E	Q^2 為 2-Br-4-MeO-Ph 並且 R^2 為 CN。
43E	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	125E	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Me。
44E	Q^2 為 2-Cl-4,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	126E	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Cl。
45E	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	127E	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Br。
46E	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	128E	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 Et。
47E	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	129E	Q^2 為 2-Br-4-EtO-Ph 並且 R^2 為 CN。
48E	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	130E	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。

表	列標題	表	列標題
49E	Q^2 為 4-Cl-2,6-二-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	131E	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。
50E	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	132E	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。
51E	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	133E	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。
52E	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	134E	Q^2 為 2-F-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。
53E	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	135E	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。
54E	Q^2 為 2-Br-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	136E	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。
55E	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	137E	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。
56E	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	138E	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。
57E	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	139E	Q^2 為 2-Cl-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。
58E	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	140E	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Me。
59E	Q^2 為 2-Br-6-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	141E	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Cl。
60E	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	142E	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Br。
61E	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	143E	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 Et。
62E	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	144E	Q^2 為 2-Br-4-CN-Ph 並且 R^2 為 CN。
63E	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	145E	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Me。
64E	Q^2 為 2-Me-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	146E	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Cl。
65E	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	147E	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Br。
66E	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	148E	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Et。
67E	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	149E	Q^2 為 3-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 CN。
68E	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	150E	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Me。
69E	Q^2 為 2-I-4-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	151E	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Cl。

表	列標題	表	列標題
70E	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Me。	152E	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Br。
71E	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Cl。	153E	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 Et。
72E	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Br。	154E	Q^2 為 3,5-二-Cl-2-吡啶基並且 R^2 為 CN。
73E	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 Et。	155E	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Me。
74E	Q^2 為 2-F-Ph 並且 R^2 為 CN。	156E	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Cl。
75E	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Me。	157E	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Br。
76E	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Cl。	158E	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Et。
77E	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Br。	159E	Q^2 為 2-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 CN。
78E	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 Et。	160E	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Me。
79E	Q^2 為 2-Cl-Ph 並且 R^2 為 CN。	161E	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Cl。
80E	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Me。	162E	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Br。
81E	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Cl。	163E	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 Et。
82E	Q^2 為 2-Br-Ph 並且 R^2 為 Br。	164E	Q^2 為 2,5-二-Cl-3-噻吩基並且 R^2 為 CN。

製劑/效用

本發明之化合物將通常使用來作為組成物（即製劑）中的殺菌活性成分，並伴隨有至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑及液體稀釋劑所組成之群組的額外成分以作為載體之用。此製劑或組成物成分係經選擇，以配合活性成分之物理性質、施用型態與土壤種類、濕度和溫度等環境因素。

有用的製劑包括液體及固體組成物。液體組成物包括溶液（包括可乳化濃縮物）、懸浮液、乳液（包括微

乳液與/或懸浮乳液(suspoemulsion))與類似者,並可選擇性地將其增稠成凝膠。水性液體組成物的一般類型為可溶濃縮物(soluble concentrate)、懸浮濃縮物(suspension concentrate)、膠囊懸浮液(capsule suspension)、濃縮乳液、微乳液和懸浮乳液。非水性液體組合物的一般類型為可乳化濃縮物、可微乳化濃縮物、可分散性濃縮物(dispersible concentrate)及油分散液(oil dispersion)。

固體組成物的一般類型為塵粉(dust)、粉劑、粒劑、丸劑(pellet)、珠劑(prill)、錠劑(pastille)、片劑、包膜(filled film)(包括種子塗覆物)與類似者,其可具有水分散性(「可濕性」)或水溶性。由成膜溶液或可流動懸浮液形成的膜和塗層在種子處理上特別有用。活性成分可以經(微)膠囊化並進一步形成懸浮液或固體製劑;或者活性成分之整體製劑可經膠囊化(或「披覆」)。膠囊化可以控制或減緩活性成分的釋放。可乳化粒劑結合了可乳化濃縮物與乾粒狀製劑的優點。高強度組成物主要用作進一步製劑的中間物。

可噴灑製劑通常在噴灑前會先在適合的介質中擴展。此類液體及固體製劑係配製為可迅速稀釋於噴灑介質(通常是水)中。噴灑的量可從每公頃約一到數千公升,但更通常為從每公頃約十到數百公升。可噴灑製劑可在桶中與水或其他適合介質混合,藉由空中或地面施用而運用於葉處理,或施用於植物的生長介質。液體製劑與乾製劑可在播種時,直接計量加入滴流灌溉系統或犁溝。液體和固體製劑可以施用於作物和其他所欲植物

的種子，作為播種前種子處理之用，以透過系統性吸收保護發育中的根及其它地下的植物部分與/或葉。

該製劑通常含有有效量的活性成分、稀釋劑和界面活性劑，其落於下列概略範圍中且重量加起來會等於百分之百。

	重量百分比		
	活性成分	稀釋劑	界面活性劑
水分散性粒劑及水溶性粒劑、片劑及粉劑	0.001-90	0-99.999	0-15
油分散液、懸浮液、乳液、溶液（包括可乳化濃縮物）	1-50	40-99	0-50
塵粉	1-25	70-99	0-5
粒劑與丸劑	0.001-95	5-99.999	0-15
高強度組成物	90-99	0-10	0-2

固體稀釋劑包括例如，黏土如膨土、微晶高嶺石、厄帖浦石與高嶺土、石膏、纖維素、二氧化鈦、氧化鋅、澱粉、糊精、糖（例如乳糖、蔗糖）、二氧化矽、滑石、雲母、矽藻土、尿素、碳酸鈣、碳酸鈉與碳酸氫鈉及硫酸鈉。典型固體稀釋劑係描述於 Watkins 等人, *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers* 第 2 版, Dorland Books, Caldwell, New Jersey 中。

液體稀釋劑包括例如水、*N,N*-二甲基烷醯胺（例如 *N,N*-二甲基甲醯胺）、萆烯、二甲亞砷、*N*-烷基吡咯啉酮（例如，*N*-甲基吡咯啉酮）、乙二醇、三甘醇、丙二醇、二丙烯甘醇、聚丙二醇、碳酸伸丙酯、碳酸伸丁酯、石蠟（例如，白礦油、正構烷烴、異烷烴）、烷基苯、

烷基萘、甘油、三乙酸甘油酯(glycerol triacetate)、山梨糖醇、芳烴、脫芳香脂族、烷基苯、烷基萘、如環己酮、2-庚酮、異佛酮及 4-羥基-4-甲基-2-戊酮的酮、如乙酸異戊酯、乙酸己酯、乙酸庚酯、乙酸辛酯、乙酸壬酯、乙酸十三酯及乙酸異茨酯的醋酸鹽、如烷化乳酸酯(alkylated lactate ester)、二元酯及 γ -丁內酯的其他酯類、以及醇類，其可為線性、分支、飽和或不飽和，如甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、正己醇、2-乙基己醇、正辛醇、癸醇、異癸醇、異十八醇、鯨蠟醇、月桂醇、十三醇、油醇、環己醇、四氫糠醇、二丙酮醇及苯甲醇。液體稀釋劑亦包括飽和以及不飽和脂肪酸（典型為 C_6 - C_{22} ）的甘油酯類，如植物種子和水果油（例如橄欖、蓖麻、亞麻仁、芝麻、玉米、花生、向日葵、葡萄籽、紅花、棉籽、黃豆、油菜籽、椰子和棕櫚仁的油）、動物源性脂肪（例如牛油、豬肉脂、豬油、鱈魚肝油、魚油）及其混合物。液體稀釋劑也包括烷化脂肪酸（例如甲基化、乙基化、丁基化），其中該脂肪酸可藉由水解來自植物和動物來源的甘油酯而獲得，並可用蒸餾純化。典型的液體稀釋劑係描述於 Marsden, *Solvents Guide*, 第 2 版, Interscience, New York, 1950 中。

本發明的固體和液體組成物通常包括一或多種界面活性劑。當加入至液體中時，界面活性劑（也已知為「界面活性劑」）通常會改變（最常為減少）液體的表面張力。取決於界面活性劑分子中親水性和親油性基的

性質，界面活性劑可用作為潤濕劑、分散劑、乳化劑或消泡劑。

界面活性劑可以分類為非離子性、陰離子性或陽離子性。可用於本發明組成物的非離子界面活性劑包括但不限於：醇烷氧化物如基於天然及合成醇（其可為分枝或線性）並從該醇類製備出的醇烷氧化物、及環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷及其混合物；乙氧基胺、烷醇醯胺及乙氧基化烷醇醯胺；烷氧基化三酸甘油酯如乙氧基化黃豆、蓖麻和油菜籽油；烷基酚烷氧化物如辛苯酚乙氧化物(octylphenol ethoxylate)、壬苯酚乙氧化物、二壬苯酚乙氧化物及十二烷苯酚乙氧化物（由苯酚及環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物所製備）；由環氧乙烷或環氧丙烷所製備的嵌段聚合物以及其中的終端嵌段由環氧丙烷所製備的反向嵌段聚合物；乙氧基化脂肪酸；乙氧基化脂肪酯和油；乙氧基化甲酯；乙氧基化三苯乙烯苯酚（包括由環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物所製備者）；脂肪酸酯、甘油酯、羊毛脂為基礎的衍生物、聚乙氧基化酯如聚乙氧基化山梨醇酐脂肪酸酯、聚乙氧基化山梨糖醇脂肪酸酯及聚乙氧基化甘油脂肪酸酯；其他山梨醇酐衍生物如山梨醇酐酯；像是聚合性界面活性劑如隨機共聚物、嵌段共聚物、醇酸 peg（聚乙二醇）、接枝或梳形聚合物及星形聚合物；聚乙二醇(peg)；聚乙二醇脂肪酸酯；聚矽氧為基礎的界面活性劑；以及糖衍生物如蔗糖酯、烷基聚葡萄糖苷和烷基多醣。

有用的陰離子界面活性劑包括但不限於：烷芳基磺酸以及其鹽；羧基化醇或烷基酚乙氧化物；二苯基磺酸鹽衍生物；木質素以及木質素衍生物，例如木質磺酸鹽；順丁烯二酸或琥珀酸或其酐；烯烴磺酸鹽；磷酸酯如醇烷氧化物之磷酸酯、烷基苯酚烷氧化物之磷酸酯與苯乙烯基苯酚乙氧化物之磷酸酯；蛋白質為基礎的界面活性劑；肌胺酸衍生物；苯乙烯酚醚硫酸酯；油和脂肪酸的硫酸鹽和磺酸鹽；乙氧基化烷基酚的硫酸鹽和磺酸鹽；醇類的硫酸鹽；乙氧基化醇類的硫酸鹽；胺和鹽胺的磺酸鹽如 *N,N*-烷牛磺酸酯；苯、異丙苯、甲苯、二甲苯及十二苯和十三苯的磺酸鹽；縮合萘的磺酸鹽；萘及烷基萘的磺酸鹽；分餾石油的磺酸鹽；磺琥珀鹽胺酸鹽(sulfosuccinamate)；及磺琥珀酸鹽(sulfosuccinate)及其衍生物如二烷基磺琥珀酸鹽。

可用之陽離子界面活性劑包括但不限於：鹽胺及乙氧基化鹽胺；胺如 *N*-烷基丙二胺、三丙烯三胺及二丙烯四胺，及乙氧基化胺、乙氧基化二胺以及丙氧基化胺（從胺及環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或其混合物製備者）；胺鹽，如胺乙酸鹽及二胺鹽；四級銨鹽如四級鹽、乙氧基化四級鹽及雙四級鹽；以及胺氧化物如烷基二甲基胺氧化物及雙-(2-羥乙基)-烷基胺氧化物。

亦可用於本發明組成物者為非離子界面活性劑與陰離子界面活性劑的混合物，或是非離子界面活性劑與陽離子界面活性劑的混合物。非離子、陰離子及陽離子界面活性劑及其建議用法係揭露於各式公開參考文獻，包括 *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*，年

度美國及國際版，McCutcheon's Division 出版，The Manufacturing Confectioner Publishing Co.；Sisely 與 Wood，*Encyclopedia of Surface Active Agents*，Chemical Publ. Co., Inc.，New York，1964；以及 A S. Davidson 與 B. Milwidsky，*Synthetic Detergents*，第七版，John Wiley and Sons，New York，1987。

本發明組合物亦可包含製劑輔助劑及添加劑，及熟悉該項技術領域者熟知之製劑助劑（其中部分亦可視為提供固體稀釋劑、液體稀釋劑或界面活性劑之功能）。該配方輔助劑及添加劑可控制：pH（緩衝溶液）、處理期間的發泡（抗發泡劑如聚有機矽氧烷）、活性成份的沉積（懸浮劑）、黏滯性（觸變增稠劑）、容器中之微生物生長（抗菌劑）、產物凍結（抗凍劑）、顏色（染料/顏料分散液）、洗除（成膜劑或黏著劑）、蒸發（蒸發阻滯劑）以及其他製劑特性。成膜劑包括例如聚乙酸乙烯、聚乙酸乙烯共聚物、聚乙烯吡咯烷酮-乙酸乙烯共聚物、聚乙烯醇、聚乙烯醇共聚物及蠟。製劑輔助劑及添加劑之實例包括列示於以下文獻者：*McCutcheon's Volume 2: Functional Materials*，年度國際及北美版，McCutcheon's Division 出版，The Manufacturing Confectioner Publishing Co.；以及 PCT 公開第 WO 03/024222 號。

式 1 或式 1A 化合物以及任何其他活性成分，典型為藉由在溶劑中溶解活性成分或在一液體或乾性稀釋劑中磨碎，而組合至本發明組成物中。藉由簡單混合成分可製備出液劑，包括可乳化濃縮物。若打算用作為可

乳化濃縮物之液體組成物的溶劑與水不互溶，則通常會在用水稀釋時，加入乳化劑以乳化該含活性成分之溶劑。粒徑高達 2,000 μ m 的活性成分漿液可使用介質研磨機濕磨，以獲得平均直徑在 3 μ m 以下的粒子。水性漿液可製成為成品懸浮濃縮物（請參見如 U.S. 3,060,084）或藉由噴霧乾燥進一步加工成水分散性粒劑。乾式配方通常需要乾磨製程，其產生的平均粒徑在 2 到 10 μ m 的範圍內。塵粉及粉劑可藉由摻合以及通常加上研磨（如以錘磨或液能研磨機）而製備。粒劑及丸劑係透過將活性材料噴灑於預成形之粒狀載體或以黏聚技術製成。請參見 Browning，「Agglomeration」，*Chemical Engineering*，1967 年 12 月 4 日，第 147-48 頁，*Perry's Chemical Engineer's Handbook*，第 4 版，McGraw-Hill, New York，1963，第 8 - 57 頁及以下，以及 WO 91/13546。丸劑可如 U.S. 4,172,714 中所述者製備。水分散性與水溶性粒劑可如 U.S. 4,144,050、U.S. 3,920,442 與 DE 3,246,493 中所教示者製備。錠劑可如 U.S. 5,180,587、U.S. 5,232,701 與 U.S. 5,208,030 所教示者製備。膜衣可如 GB 2,095,558 與 U.S. 3,299,566 所教示者製備。

有關製劑技術之進一步資訊，請見 T. S. Woods，「The Formulator's Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture」於 *Pesticide Chemistry and Bioscience*，*The Food-Environment Challenge*，T. Brooks 與 T. R. Roberts 編輯，*Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry*，The Royal Society of Chemistry，

Cambridge, 1999, 第 120 至 133 頁。亦請參見美國專利第 3,235,361 號第 6 欄 16 行到第 7 欄 19 行及實例 10 - 41; 美國專利第 3,309,192 號第 5 欄 43 行到第 7 欄 62 行及實例 8、12、15、39、41、52、53、58、132、138 - 140、162 - 164、166、167 及 169 - 182; 美國專利第 2,891,855 號第 3 欄 66 行到第 5 欄 17 行及實例 1 - 4;; Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, 第 81 至 96 頁; Hance 等人, *Weed Control Handbook*, 第八版, Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; 以及 *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000。

在下面的實例中,所有的百分比均為按重量計且所有的製劑均以常規方式製備。化合物編號則參照索引表 A 至 C 中的化合物。即使沒有進一步的闡述,相信使用上述說明的熟習該項技術者仍能夠最大程度地利用本發明。因此,以下實例僅為說明之用,而絕非用於限制本發明之揭露內容。除非另有說明,百分比為按重量計。

實例 A

高強度濃縮物

化合物 10	98.5%
二氧化矽氣凝膠	0.5%
合成非晶質細二氧化矽	1.0%

實例 B

可濕性粉末

化合物 3	65.0%
-------	-------

201245155

十二烷基酚聚乙二醇醚	2.0%
木質磺酸鈉	4.0%
矽鋁酸鈉	6.0%
蒙脫土（經煅燒）	23.0%

實例 C

粒劑

化合物 10	10.0%
厄帖浦石粒劑（低揮發性物質，0.71/0.30 mm；U.S.S. No. 25 至 50 篩）	90.0%

實例 D

擠製顆粒

化合物 14	25.0%
無水硫酸鈉	10.0%
粗木質磺酸鈣	5.0%
烷基萘磺酸鈉	1.0%
鈣/鎂膨土	59.0%

實例 E

可乳化濃縮物

化合物 3	10.0%
聚氧乙烯山梨糖醇六油酸酯(polyoxyethylene sorbitol hexoleate)	20.0%
C ₆ -C ₁₀ 脂肪酸甲酯	70.0%

實例 F

微乳液

化合物 10	5.0%
聚乙烯基吡咯烷酮-乙烯乙酸酯共聚物	30.0%
烷基聚葡萄糖苷(alkylpolyglycoside)	30.0%
甘油單油酸酯(glyceryl monooleate)	15.0%
水	20.0%

實例 G

種子處理

化合物 14	20.00%
聚乙烯吡咯啉酮-乙烯乙酸鹽共聚物	5.00%
褐煤酸蠟	5.00%
木質磺酸鈣	1.00%
聚氧乙烯/聚氧丙烯嵌段共聚物	1.00%
硬脂醇(POE 20)	2.00%
聚有機矽烷(polyorganosilane)	0.20%
紅色染料	0.05%
水	65.75%

水溶性及水分散性製劑一般在施用前會以水稀釋以形成水性組成物。直接施用於植物或其一部分的水性組成物（例如噴灑槽組成物）通常含至少約 1 ppm 或更多（例如從 1 ppm 至 100 ppm）的本發明之化合物。

本發明的化合物可用作為植物病害防治劑。因此本發明進一步包含一種防治由真菌植物病原體引起之植物病害的方法，其包含施予該待保護植物或其部分，或向待保護植物種子一有效量之本發明化合物或含有該化合物的殺真菌組成物。本發明的化合物及/或組成物能防治由擔子菌綱、子囊菌綱、卵菌綱及不完全菌綱中廣泛真菌植物病原體所引起的病害。其可有效防治多種植物疾病，尤其是觀賞植物、草皮、蔬菜、田地、穀類及水果作物之葉部病原體。這些病原體包括：卵菌類(Oomycetes)，包括疫病菌屬(*Phytophthora*)病害，如馬鈴薯疫病菌(*Phytophthora infestans*)、大豆疫病菌(*Phytophthora megasperma*)、柑橘疫病菌(*Phytophthora parasitica*)、樟樹疫病菌(*Phytophthora cinnamomi*)與番

椒疫病菌 (*Phytophthora capsici*)，草苗立枯病菌屬 (*Pythium*) 病害如胡瓜猝倒病菌 (*Pythium aphanidermatum*)，以及霜霉科 (*Peronosporaceae*) 家族中之病害如葡萄露菌病菌 (*Plasmopara viticola*)、小葉菜類露菌病菌 (*Peronospora* spp.) (包括菸草露菌病菌 (*Peronospora tabacina*) 與油菜露菌病菌 (*Peronospora parasitica*))、白粉病菌 (*Pseudoperonospora* spp.) (包括瓜白粉病菌 (*Pseudoperonospora cubensis*) 與露菌病菌 (*Bremia lactucae*)；子囊菌綱 (*Ascomycetes*)，包括馬鈴薯葉燒病菌屬 (*Alternaria*) 病害如早疫病菌 (*Alternaria solani*) 與黑斑病菌 (*Alternaria brassicae*)，赤枯病菌屬 (*Guignardia*) 病害如葡萄黑腐病菌 (*Guignardia bidwell*)，黑星病菌屬 (*Venturia*) 病害如蘋果黑星病菌 (*Venturia inaequalis*)，殼針孢屬 (*Septoria*) 病害如小麥穎枯病菌 (*Septoria nodorum*) 與小麥葉斑病菌 (*Septoria tritici*)，白粉病害如白粉菌屬 (*Erysiphe* spp.) (包括布氏白粉菌 (*Erysiphe graminis*) 與豆類白粉病菌 (*Erysiphe polygoni*))、鉤絲黴菌 (*Uncinula necatur*)、單絲殼白粉菌 (*Sphaerotheca fuliginea*) 與蘋果白粉病菌 (*Podosphaera leucotricha*)、小麥基腐病菌 (*Pseudocercospora herpotrichoides*)，灰黴屬 (*Botrytis*) 病害如灰黴病菌 (*Botrytis cinerea*)、褐腐病菌 (*Monilinia fructicola*)，核盤菌屬 (*Sclerotinia*) 病害如菌核病菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*)、稻熱病菌 (*Magnaporthe grisea*)、葡萄枝枯病菌 (*Phomopsis viticola*)、麥類胡麻葉枯病菌屬 (*Helminthosporium*) 病害如小麥德氏黴菌

(*Helminthosporium tritici repentis*)、大麥網斑病菌 (*Pyrenophora teres*)，炭疽病害如炭疽病菌屬 (*Glomerella*) 或棉黑斑病菌屬 (*Colletotrichum* spp.) (例如禾本科炭疽病菌 (*Colletotrichum graminicola*) 與西瓜炭疽病菌 (*Colletotrichum orbiculare*)，以及小麥全蝕病菌 (*Gaeumannomyces graminis*)；擔子菌綱 (*Basidiomycetes*)，包括由以下造成之葉鏽病：鏽病菌屬 (*Puccinia* spp.) (例如小麥葉鏽病菌 (*Puccinia recondita*)、小麥條鏽病菌 (*Puccinia striiformis*)、大麥柄鏽病菌 (*Puccinia hordei*)、小麥桿鏽病菌 (*Puccinia graminis*) 與花生鏽病菌 (*Puccinia arachidis*)、駝孢鏽病菌 (*Hemileia vastatrix*) 與大豆鏽病菌 (*Phakopsora pachyrhizi*)；其他病原體包括絮狀蠟盤菌 (*Rutstroemia floccosum*) (亦已知為 *Sclerontina homoeocarpa*)；黑痣病菌屬 (*Rhizoctonia* spp.) (例如樹木苗立枯病菌 (*Rhizoctonia solani*))；鐮刀菌屬 (*Fusarium*) 病害如石竹類立枯病菌 (*Fusarium roseum*)、禾穀鐮刀菌 (*Fusarium graminearum*) 與尖鐮孢菌 (*Fusarium oxysporum*)；棉花黃萎病菌 (*Verticillium dahliae*)；白絹菌 (*Sclerotium rolfsii*)；大麥雲紋病菌 (*Rhynchosporium secalis*)；球座尾孢菌 (*Cercosporidium personatum*)、花生尾孢菌 (*Cercospora arachidicola*) 與甜菜葉斑病菌 (*Cercospora beticola*)；以及其他與這些病原體緊密相關的屬與種。除了其殺真菌活性外，該些組成物或組合物亦可具有抗細菌活性，例如梨及蘋果火傷病菌 (*Erwinia*

amylovora)、黑腐病菌(*Xanthomonas campestris*)、細菌性斑點病菌(*Pseudomonas syringae*)，以及其他相關種。

一般藉由在感染前或感染後，向該植物所要保護的部份，如根、莖、葉、果實、種子、塊莖或球莖，或向所要保護的植物生長其中的介質（土壤或沙），施予一有效量的本發明化合物，可完成植物病害防治。也可向種子施予該化合物以保護該種子，以及向從種子發育出的幼苗施予該化合物。也可透過灌溉用水施用該化合物來處理植物。

這些化合物之施用率（即殺真菌有效量）可受到眾多因素影響，例如待防治之植物病害、待保護之植物物種、環境濕度與溫度並且應依據實際使用條件來決定。熟習該項技術者可輕易透過簡單實驗來測定達到所欲植物疾病防治程度所需的殺真菌有效量。當施用的活性成分比率從少於約 1 g/ha 到約 5,000 g/ha 時，通常可以保護葉子。以約 0.1 至約 10 g 每公斤種子之施用率處理種子，一般可保護種子以及幼苗。

也可將本發明化合物與一個或多個其他具有生物活性的化合物或包括殺真菌劑、殺蟲劑、殺線蟲劑、殺菌劑、殺蟎劑、除草劑、除草劑解毒劑、如昆蟲蛻皮抑制劑及生根興奮劑(rooting stimulants)的生長調節素、化學滅菌劑、化學傳訊素(semiochemicals)、驅蟲劑(repellents)、引誘劑、費洛蒙、激食因子(feeding stimulants)、植物營養劑的劑、其他具有生物活性的化合物或蟲生細菌、病毒或真菌混合，以形成一多成分殺蟲劑，提供更廣泛的農業保護。因此本發明亦適用於一

包含一式 1 或式 1A 化合物（以殺真菌有效量）之組成物，以及至少一種額外生物活性化合物或藥劑，並可進一步包含至少一種界面活性劑、固體稀釋劑或液體稀釋劑。其他生物活性化合物或藥劑可配製於組成物中，該組成物包含至少一種界面活性劑、固體或液體稀釋劑。對於本發明之混合物而言，一或多種其他生物活性化合物或藥劑可與一式 1 或式 1A 化合物一起配製，以形成一預混物，或一或多種其他生物活性化合物或藥劑可與該式 1 或式 1A 化合物分開配製，並且該製劑在施用前先行結合（例如在一個噴灑桶中），或是依序施用。

值得注意的組成物為除了式 1 或式 1A 化合物外尚包括至少一種殺真菌化合物者，其係選自由以下種類所組成之群組：(1) 苯并咪唑胺甲酸甲酯(MBC)類殺真菌劑；(2) 二羧亞醯胺類殺真菌劑；(3) 去甲基作用抑制劑(DMI)類殺真菌劑；(4) 苯醯胺類殺真菌劑；(5) 胺/嗎啉(amine/morpholine)類殺真菌劑；(6) 磷脂質生物合成抑制劑類殺真菌劑；(7) 羧醯胺類殺真菌劑；(8) 羥基(2-胺基-)嘧啶類殺真菌劑；(9) 苯胺嘧啶類殺真菌劑；(10) *N*-苯基胺基甲酸酯類殺真菌劑；(11) 醌外抑制劑(QoI)類殺真菌劑；(12) 苯基吡咯類殺真菌劑；(13) 喹啉類殺真菌劑；(14) 脂質過氧化抑制劑類殺真菌劑；(15) 黑色素生物合成抑制劑-還原酶(MBI-R)類殺真菌劑；(16) 黑色素生物合成抑制劑-脫水酶(MBI-D)類殺真菌劑；(17) 羥基苯胺類殺真菌劑；(18) 鯊烯-環氧酶抑制劑類殺真菌劑；(19) 多氧菌素(polyoxin)類殺真菌劑；(20) 苯脲類殺真菌劑；(21) 醌內抑制劑(QiI)類殺真菌劑；(22) 苯甲醯胺類

殺真菌劑；(23)吡喃糖醛酸(enopyranuronic acid)抗生素類殺真菌劑；(24)己吡喃糖基抗生素類殺真菌劑；(25)葡萄吡喃糖抗生素：蛋白質合成類殺真菌劑；(26)葡萄吡喃糖抗生素：繭蜜糖酶及肌醇生物合成殺真菌劑；(27)氰乙醯胺肟(cyanoacetamideoxime)類殺真菌劑；(28)胺基甲酸酯類殺真菌劑；(29)氧化磷酸化解偶合類殺真菌劑；(30)有機錫類殺真菌劑；(31)羧酸類殺真菌劑；(32)雜芳香族類殺真菌劑；(33)磷酸鹽類殺真菌劑；(34)鄰胺甲醯苯甲酸類殺真菌劑；(35)苯并三【口+井】(benzotriazine)殺真菌劑；(36)苯-磺醯胺類殺真菌劑；(37)嗒【口+井】酮(pyridazinone)類殺真菌劑；(38)噻吩-羧醯胺類殺真菌劑；(39)嘧啶醯胺類殺真菌劑；(40)羧酸醯胺(CAA)類殺真菌劑；(41)四環素類抗生素殺真菌劑；(42)硫胺甲酸酯類殺真菌劑；(43)苯甲醯胺類殺真菌劑；(44)誘發寄主植物防禦類殺真菌劑；(45)多重位點接觸活性類殺真菌劑；(46)非種類(1)至(45)之殺真菌劑；以及種類(1)至(46)之鹽類。

以下進一步說明此等殺真菌化合物。

(1)「苯并咪唑胺基甲酸甲酯(MBC)類殺真菌劑」(FRAC (國際殺真菌劑抗藥性執行委員會，Fungicide Resistance Action Committee)代碼 1)藉由在微管組合期間結合至 β -微管蛋白抑制有絲分裂。抑制微管組合可中斷細胞分裂、細胞以及細胞結構內傳輸。苯并咪唑胺基甲酸甲酯殺真菌劑包括苯并咪唑類以及多保淨(thiophanate)類殺真菌劑。該苯并咪唑類包括免賴得(benomyl)、貝芬替(carbendazim)、麥穗寧(fuberidazole)

以及涕必靈(thiabendazole)。該多保淨類包括多保淨以及甲基多保淨(thiophanate-methyl)。

(2) 已提出「二羧亞醯胺類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 2) 經由以 NADH 細胞色素 c 還原酶干擾而抑制真菌中的脂質過氧化作用。實例包括克氯得(chlozolate)、依普同(iprodione)、撲滅寧(procymidone)以及免克寧(vinclozolin)。

(3) 「去甲基作用抑制劑(DMI)類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 3) 抑制之 C14-去甲基酶，其與固醇產生有關。固醇，如麥角脂醇，為膜結構及機能所需，因而為機能細胞壁發展之必要物質。因此，暴露於此種殺真菌劑將使易感真菌產生異常成長，最終死亡。DMI 殺真菌劑分為數種化學種類：氮雜茂(包括三氮雜茂以及咪唑)、嘧啶、吡嗪以及吡啶。該三唑類包括阿扎康唑(azaconazole)、比多農(bitertanol)、溴克座(bromuconazole)、環克座(cyproconazole)、待克利(difenoconazole)、達克利(diniconazole) (包括達克利-M)、依普座(epoxiconazole)、芬克座(fenbuconazole)、氟喹唑(fluquinconazole)、護矽得(flusilazole)、護汰芬(flutriafol)、菲克利(hexaconazole)、易胺座(imibenconazole)、種菌唑(ipconazole)、滅特座(metconazole)、邁克尼(myclobutanil)、平克座(penconazole)、普克利(propiconazole)、丙硫菌唑(prothioconazole)、矽氟唑(simeconazole)、得克利(tebuconazole)、四克利(tetraconazole)、三泰芬

(triadimefon)、甲三泰隆(triadimenol)、滅菌唑(triticonazole)及單克素(uniconazole)。該咪唑類包括克霉唑(clotrimazole)、依滅列(imazalil)、惡咪唑(oxpoconazole)、撲克拉(prochloraz)、披扶座(pefurazoate)及賽福座(triflumizole)。該嘧啶類包括芬瑞莫(fenarimol)以及尼瑞莫(nuarimol)。哌【口+井】包括賽福寧(triforine)。該吡啶類包括比芬諾(pyrifenox)。生化研究顯示以上所有殺真菌劑皆為 DMI 殺真菌劑，如 K. H. Kuck 等人於 *Modern Selective Fungicides – Properties, Applications and Mechanisms of Action*，H. Lyr 編輯，Gustav Fischer Verlag：New York，1995，205-258 所描述者。

(4) 「苯醯胺類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 4) 是卵菌類真菌中 RNA 聚合酶的特定抑制劑。曝露於這些殺真菌劑中的易感性真菌顯示其將尿苷結合至 rRNA 之能力降低。藉由曝露於此類殺真菌劑可防止易感真菌之生長以及發展。苯醯胺類殺真菌劑包括醯丙胺酸(acylalanine)類、【口+罒】唑啉酮(oxazolidinone)類及丁內酯類殺真菌劑。該醯丙胺酸類包括本達樂(benalaxyl)、本達樂-M、呋霜靈(furalaxyl)、滅達樂(metalaxyl)、滅達樂-M/右滅達樂(mefenoxam)。該【口+罒】唑啉酮類包括毆殺斯(oxadixyl)。該丁內酯類包括呋醯胺(ofurace)。

(5) 「胺/嗎啉類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 5) 抑制在固醇類生物合成途徑內的兩個標靶位點， $\Delta^8 \rightarrow \Delta^7$ 異構酶以及 Δ^{14} 還原酶。

固醇，如麥角脂醇，為膜結構及機能所需，因而為機能細胞壁發展之必要物質。因此，暴露於此種殺真菌劑將使易感真菌產生異常成長，最終死亡。該胺/嗎啉類殺真菌劑（又稱為非 DMI 固醇生物合成抑制劑）包括嗎啉類、哌啶以及螺縮酮-胺殺真菌劑。該嗎啉類包括愛地福(aldimorph)、十二環嗎啉(dodemorph)、芬普福(fenpropimorph)、三得芬(tridemorph)以及三芬醯胺(trimorphamide)。該哌啶類包括苯鏽啶(fenpropidin)以及粉病靈(piperalin)。該螺縮酮胺類包括甚孢菌素(spiroxamine)。

(6) 「磷脂生物合成抑制劑類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 6)藉由影響磷脂生物合成而抑制真菌成長。磷脂生物合成殺真菌劑包括硫代磷酸酯(phosphorothiolate)與二硫【口+東】(dithiolane)殺真菌劑。該硫代磷酸酯類包括護粒松(edifenphos)、丙基喜樂松(iprobenfos)以及白粉松(pyrazophos)。該二硫【口+東】類包括亞賜圃(isoprothiolane)。

(7) 「羧醯胺類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 7 藉由阻斷克氏循環(TCA cycle)中稱為琥珀酸脫氫酶的關鍵酵素來抑制錯合物 II (琥珀酸脫氫酶) 真菌呼吸作用。抑制呼吸作用可防止真菌製造 ATP，從而抑制成長以及繁殖。羧醯胺殺真菌劑包括苯甲醯胺(benzamide)、呋喃羧醯胺(furan carboxamide)、【口+号】噻羧醯胺(oxathiin carboxamide)、噻唑羧醯胺(thiazole carboxamide)、吡唑羧醯胺(pyrazole carboxamide)及吡啶羧醯胺(pyridine

carboxamide)。該苯甲醯胺類包括麥鏽靈(benodanil)、福多寧(flutolanil)以及滅普寧(mepronil)。該呋喃羧醯胺包括甲呋醯胺(fenfuram)。該【口+号】噻羧醯胺包括萎鏽靈(carboxin)以及嘉保信(oxycarboxin)。該噻唑羧醯胺包括賽氟滅(thifluzamide)。該吡唑羧醯胺包括福拉比(furametpyr)、吡噻菌胺(penthiopyrad)、必殺芬(bixafen)、isopyrazam、*N*-[2-(1*S*,2*R*)-[1,1'-雙環丙基]-2-基苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-羧醯胺及派福芬(penflufen) (*N*-[2-(1,3-二甲丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-羧醯胺)。該哌啶羧醯胺包括白克列(boscalid)。

(8) 「羥基(2-胺基-)嘧啶類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 8)藉由以腺苷去胺酶干擾來抑制核酸合成。實例包括布瑞莫(bupirimate)、二甲依瑞莫(dimethirimol)以及依瑞莫(ethirimol)。

(9) 「苯胺基嘧啶殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 9)係提出以抑制胺酸蛋氨酸生物合成，以中斷傳染過程中溶解植物細胞的水解酵素分泌。實例包括賽普洛(cyprodinil)、滅派林(mepanipyrim)以及派美尼(pyrimethanil)。

(10) 「*N*-苯基胺基甲酸酯類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 10)在微管組合中結合β-微管蛋白以抑制分裂。抑制微管組合可中斷細胞分離、細胞以及細胞結構內傳輸。實例包括乙霉威(diethofencarb)。

(11) 「醌外抑制劑(QoI)類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 11 藉由影響泛醌氧化酶(ubiquinol oxidase)來抑制真菌中錯合物 III 粒線體的呼吸作用。泛醌氧化被阻斷於細胞色素 bc_1 錯合物「醌外」(Q_o)位點，其位於真菌之內粒線體膜中。抑制粒線體呼吸作用可防止正常真菌成長以及發展。醌外抑制劑類殺真菌劑(亦已知為嗜球果傘素(strobilurin)類殺真菌劑)包括甲氧丙烯酸酯(methoxyacrylate)、甲氧胺基甲酸酯(methoxycarbamate)、羥亞胺基乙酸酯(oximinoacetate)、羥亞胺基乙醯胺(oximinoacetamide)、二氫二【口+𠃊】[口+井](dihydrodioxazine)、【口+𠃊】唑啉二酮(oxazolidinedione)、咪唑啉酮(imidazolinone)與苯甲基胺基甲酸酯(benzylcarbamate)類殺真菌劑。該甲氧丙烯酸酯類包括亞托敏(azoxystrobin)、烯肱菌酯(enestroburin) (SYP-Z071)以及啞氧菌酯(picoxystrobin) (SYP-3343)。該甲氧胺基甲酸酯類包括百克敏(pyraclostrobin)及啞胺菌酯(pyrametostrobin) (SYP-4155)。該羥亞胺基醋酸鹽類包括克收欣(kresoxim-methyl)及三氟敏(trifloxystrobin)。該羥亞胺基乙醯胺類包括醚菌胺(dimoxystrobin)、苯氧菌胺(metominostrobin)、肱醚菌胺(orysastrobin)、 α -[甲氧亞胺基]-*N*-甲基-2-[[[1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基]亞胺基]甲基]苯乙醯胺以及 2-[[[3-(2,6-二氯苯基)-1-甲基-2-丙烯-1-亞基]胺基]氧基]甲基]- α -(甲氧亞胺基)-*N*-甲基苯乙醯胺。該【口+𠃊】唑啉二酮包括凡殺同(fluoxastrobin)。該二氫二【口+𠃊】【口+井】包括氟嘧

菌酯 (fluoxastrobin)。該咪唑啉酮包括咪唑菌酮 (fenamidone)。該苯甲基胺基甲酸酯包括防霉丹 (pyribencarb)。

(12) 「苯基吡咯類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 12) 抑制與真菌中與滲透信號轉導有關的一個 MAP 蛋白質激酶。拌種咯 (Fenpiclonil) 以及護汰寧 (fludioxonil) 為此類殺真菌劑之實例。

(13) 「喹啉類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 13) 係提出以藉由影響在早期細胞信號傳遞中的 G 蛋白來抑制信號轉導。已顯示它們干擾真菌(造成白粉病)的萌芽與/或附著器(appressorium)形成。快諾芬(Quinoxifen)及泰伏勤(tebufloquin)為此類殺真菌劑的實例。

(14) 「脂質過氧化抑制劑類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 14) 係提出以抑制影響真菌中之膜合成的脂質過氧化反應。此類殺真菌劑之成員(如依得利(etridiazole))亦可能影響其他生物程序,例如呼吸作用以及黑色素之生物合成。脂質過氧化作用殺真菌劑包括芳族碳以及 1,2,4-噻二唑殺真菌劑。該芳香族碳殺真菌劑包括聯苯、地茂散(chloroneb)、氯硝胺(dicloran)、五氯硝基苯(quintozene)、四氯硝基苯(tecnazene)以及脫克松(tolclofos-methyl)。1,2,4-噻二唑殺真菌劑包括依得利(etridiazole)。

(15) 「黑色素生物合成抑制劑-還原酶(MBI-R)類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代

碼 16.1) 抑制黑色素生物合成中萘亞甲基還原(naphthal reduction)步驟。黑色素為某些真菌感染宿主植物所必須。黑色素生物合成抑制劑-還原酶類殺真菌劑包括異苯并呋喃酮(isobenzofuranone)類、吡咯并喹啉(pyrroloquinolinone)類以及三唑苯并噻唑(triazolobenzothiazole)類殺真菌劑。該異苯并呋喃酮類包括熱必斯(ftalide)。該吡咯并喹啉類包括百快隆(pyroquilon)。該三唑苯并噻唑類包括三賽唑(tricyclazole)。

(16) 「黑色素生物合成抑制劑-脫水酶(MBI-D)類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 16.2) 抑制黑色素生物合成中之細特隆(scytalone)脫水酶。黑色素為某些真菌傳染宿主植物所必需。黑色素生物合成抑制物-脫水酶殺真菌劑包括環丙烷羧醯胺、羧醯胺以及丙醯胺殺真菌劑。該環丙烷羧醯胺包括加普胺(carpropamid)。該羧醯胺包括雙氯氰菌胺(diclocymet)。該丙醯胺包括氰菌胺(fenoxanil)。

(17) 「羥基苯胺類殺真菌劑(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 17) 抑制在固醇產生中具重要地位的 C4-去甲基酶。實例包括環醯菌胺。

(18) 「鯊烯-環氧酶抑制劑類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 18) 在麥角固醇生物合成途徑中抑制鯊烯-環氧酶。固醇如麥角固醇為膜結構及機能所需，因而為機能細胞壁發展之必要物質。因此，曝露於這些殺真菌劑將使易感真菌產生異常成長，最終死亡。鯊烯-環氧酶抑制劑類殺真菌劑包括硫

胺甲酸酯(thiocarbamate)以及烯丙基胺(allylamine)殺真菌劑。該硫胺甲酸酯包括稗草畏(pyributicarb)。該烯丙基胺包括納芙迪芬(naftifine)以及特比萘酚(terbinafine)。

(19) 「多氧菌素類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 19) 抑制幾丁質合成酶。實例包括多氧菌素(polyoxin)。

(20) 「苯脲類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 20) 係提出以影響細胞分裂。實例包括賓克隆(pencycuron)。

(21) 「醌內抑制劑(QiI)類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 21) 藉由影響泛醌還原酶來抑制真菌中錯合物 III 粒線體呼吸作用。泛醌還原酶被阻斷於細胞色素 bc_1 錯合物「醌內」(Q_i)位置，其位於真菌內粒線體膜。抑制粒線體呼吸作用可防止正常真菌成長以及發展。醌內抑制劑類殺真菌劑包括氰咪唑(cyanoimidazole)以及胺磺醯基三唑(sulfamoyltriazole)殺真菌劑。該氰咪唑包括賽座滅(cyazofamid)。該胺磺醯基三唑殺真菌劑包括吡啶磺菌胺(amisulbrom)。

(22) 「苯甲醯胺類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 22) 在微管組合中結合 β -微管蛋白以抑制分裂。抑制微管組合可阻斷細胞分裂、細胞以及細胞結構內之傳輸。實例包括座賽胺(zoxamide)。

(23) 「吡喃醣醛酸類抗生素殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 23) 藉由影響蛋白

質生物合成來抑制真菌成長。實例包括保米黴素(blasticidin-S)。

(24) 「己吡喃糖基抗生素類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 24) 藉由影響蛋白質生物合成來抑制真菌成長。實例包括嘉賜黴素(kasugamycin)。

(25) 「葡萄呷喃糖抗生素：蛋白質合成類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 25) 藉由影響蛋白質生物合成來抑制真菌成長。實例包括鏈黴素(streptomycin)。

(26) 「葡萄呷喃糖抗生素：繭蜜糖酶以及肌醇生物合成類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 26) 抑制肌醇生物合成途徑中之繭蜜糖酶。實例包括維利黴素(validamycin)。

(27) 「氰乙醯胺肟類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 27) 包括克絕(cymoxanil)。

(28) 「胺基甲酸酯類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 28) 被認為是真菌生長的多位點抑制劑。其可干擾細胞膜中之脂肪酸合成，其之後阻斷細胞膜滲透性。普拔克(propamcarb)、普拔克-鹽酸鹽(propamcarb-hydrochloride)、愛得寶(iodocarb)與胺丙威(prothiocarb)是此類殺真菌劑的實例。

(29) 「氧化磷酸化解偶合類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 29) 藉由解偶合氧化磷酸化抑制真菌呼吸作用。抑制呼吸作用會防止真菌正常成長以及發展。此類藥劑包括 2,6-二硝苯胺如扶吉

胺(fluazinam)、嘧啶酮脒(pyrimidonehydrazone)如富米綜(ferimzone)以及二硝苯基巴豆酸酯如白粉克(dinocap)、氧乙酸基白粉克(meptyldinocap)以及百蟊克(binapacryl)。

(30) 「有機錫類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 30) 於氧化磷酸化途徑中抑制腺苷三磷酸鹽(ATP)合成酶。實例包括三苯醋錫(fentin acetate)、三苯氯錫(fentin chloride)以及三苯羥錫(fentin hydroxide)。

(31) 「羧酸類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 31)藉由影響去氧核糖核酸(DNA)第二型拓撲異構酶(旋轉酶)來抑制真菌生長。實例包括歐索林酸(oxolinic acid)。

(32) 「雜芳族類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 32)係提出以影響 DNA/核糖核酸(RNA)合成。雜芳族類殺真菌劑包括異【口+𠃊】唑(isoxazole)以及異噻唑酮(isothiazolone)殺真菌劑。異【口+𠃊】唑包括殺紋寧(hymexazole)，而異噻唑酮包括辛噻酮(octhilinone)。

(33) 「膦酸鹽類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 33) 包括亞磷酸以及其多種鹽類，包括福賽得(fosetyl-aluminum)。

(34) 「鄰胺甲醯苯甲酸類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 34) 包括克枯爛(teclofthalam)。

(35) 「苯并三【口+井】類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 35) 包括包括咪唑嗪(triazoxide)。

(36) 「苯-磺醯胺類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 36) 包括氟硫滅(flusulfamide)。

(37) 「噻【口+井】酮類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 37) 包括達滅淨(diclomezine)。

(38) 「噻吩-羧醯胺類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 38) 係提出以影響 ATP 產生。實例包括矽噻菌胺(silthiofam)。

(39) 「嘧啶醯胺類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 39) 藉由影響磷脂質生物合成來抑制真菌的生長並且包含二氟林(diflumetorim)。

(40) 「羧酸醯胺(CAA)類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 40) 係提出以用於抑制磷脂質生物合成以及細胞壁沉積。抑制此等程序可防止目標真菌成長並導致其死亡。羧酸醯胺類殺真菌劑包括肉桂酸醯胺、纈胺醯胺胺基甲酸酯(valinamide carbamate)以及苦杏仁酸醯胺殺真菌劑。該肉桂酸醯胺包括達滅芬(dimethomorph)以及氟嗎啉(flumorph)。該纈胺醯胺胺基甲酸酯包括苯噻菌胺(benthiavalicarb)、苯噻菌胺-異丙基(benthiavalicarb-isopropyl)、丙森鋅(iprovalicarb)、瓦芬耐(valifenalate)與 valiphenal。苦杏仁酸醯胺包括曼普胺(mandipropamid)、*N*-[2-[4-[[3-(4-

氣苯基)-2-丙炔-1-基]氧基]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲磺醯基)胺]丁醯胺以及 *N*-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧基]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(乙磺醯基)胺基]丁醯胺。

(41) 「四環素抗生素類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 41) 藉由影響錯合物 1 菸鹼醯胺腺嘌呤二核苷酸(NADH)氧化還原酶來抑制真菌生長。實例包括氧四環素(oxytetracycline)。

(42) 「硫胺甲酸酯類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 42) 包括減速克(methasulfocarb)。

(43) 「苯甲醯胺類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 43) 藉由類血影(spectrin-lik)蛋白質的非定域化作用來抑制真菌生長。實例包括氟吡啶醯菌胺(acylpicolide)殺真菌劑如氟比來(fluopicolide)以及氟吡菌醯胺(fluopyram)。

(44) 「誘發寄主植物防禦類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 P) 誘發寄主植物防禦機制。誘發寄主植物防禦類殺真菌劑包括苯并噻二唑(benzo-thiadiazole)、苯并異噻唑(benzisothiazole)以及噻二唑-羧醯胺(thiadiazole-carboxamide)殺真菌劑。該苯并噻二唑類包括阿拉酸式苯-S-甲基(acibenzolar-S-methyl)。該苯并異噻唑包括撲殺熱(probenazole)。該噻二唑-羧醯胺包括噻醯菌胺(tiadinil)以及異噻菌胺(isotianil)。

(45) 「多重位點接觸類殺真菌劑」透過多作用位點來抑制真菌生長並且具有接觸/預防性活性。殺真菌劑種類包括：(45.1)「銅類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 M1)、「(45.2)「硫類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 M2)、「(45.3)「二硫胺甲酸酯類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 M3)、「(45.4)「酞醯亞胺類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 M4)、「(45.5)「氯氰類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 M5)、「(45.6)「磺醯胺類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 M6)、「(45.7)「胍類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 M7)、「(45.8)「三【口+井】類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 M8)以及(45.9)「醌類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 M9)。「銅類殺真菌劑」為含銅無機化合物，通常為銅(II)氧化態；實例包括氯氧化銅、硫酸銅以及氫氧化銅，包括組合物如波爾多(Bordeaux)混合液(三元硫酸銅)。「硫類殺真菌劑」為含硫原子環或鏈之無機化學物；實例包括元素硫。「二硫胺甲酸酯類殺真菌劑」包含二硫胺甲酸酯分子部分；實例包括鋅錳乃浦(mancozeb)、免得爛(metiram)、甲基鋅乃浦(propineb)、富爾邦(ferbam)、錳乃浦(maneb)、得恩地(thiram)、鋅乃浦(zineb)與福美鋅(ziram)。「酞醯亞胺類殺真菌劑」包含酞醯亞胺分子部分；實例包括福爾培(folpet)、蓋普丹(captan)與四氯丹(captafol)。「氯腈類

殺真菌劑」包含經氯及氟取代之芳族環；實例包括四氯異苯腈(chlorothalonil)。「磺醯胺類殺真菌劑」包括益發靈(dichlofluanid)與基益發靈(tolyfluanid)。「胍類殺真菌劑」包括多寧(dodine)、雙胍辛胺(guazatine)、克熱淨烷苯磺酸鹽(iminoctadine albesilate)與克熱淨三乙酸鹽(iminoctadine triacetate)。三【口+井】類殺真菌劑」包括敵菌靈(anilazine)。「醌類殺真菌劑」包括腈硫醌(dithianon)。

(46) 「非種類(1)至(45)之殺真菌劑」包括某些作用機轉尚不明瞭的殺真菌劑。這些殺真菌劑包括：(46.1)「噻唑羧醯胺類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 U5)、(46.2)「苯基乙醯胺類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 U6)、(46.3)「喹唑啉酮類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 U7)、(46.4)「二苯基酮類殺真菌劑」(國際殺真菌劑抗藥性執行委員會(FRAC)代碼 U8)及(46.5)「三唑并嘧啶類殺真菌劑」。該噻唑羧醯胺包括噻唑菌胺(ethaboxam)。該苯基乙醯胺類包括賽芬胺(cyflufenamid)以及 *N*-[[[(環丙甲氧基)胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]-亞甲基]苯乙醯胺。該喹唑啉酮類包括丙氧喹啉(proquinazid)。該二苯基酮類包括滅芬農(metrafenone)。該三唑并嘧啶類包括辛唑嘧菌胺(ametoctradin)。種類(46) (即「非種類(1)至(45)之殺真菌劑」、亦包括比托沙(bethoxazin)、氟吡唑(fluxapyroxad)、新阿蘇仁(鐵甲砷酸銨)、派芬農(pyriofenone)、吡咯菌素(pyrrolnitrin)、滅蟎蟻

(quinomethionate)、泰伏勤(tebufloquin)、*N*-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧基]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲磺醯基)胺基]丁醯胺、*N*-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧基]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(乙磺醯基)胺基]丁醯胺、2-[[2-氟-5-(三氟甲基)苯基]硫基]-2-[3-(2-甲氧苯基)-2-亞四氫噻唑基]乙腈、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-3-異【口+罅】唑啶基]吡啶、*N*-[1-[[[1-(4-氯苯基)乙基]磺醯基]甲基]丙基]胺基甲酸4-氯苯基酯、5-氯-6-(2,4,6-三氯苯基)-7-(4-甲吡啶-1-基)[1,2,4]三唑并[1,5-*a*]嘧啶、*N*-(4-氯-2-硝苯基)-*N*-乙基-4-甲苯磺醯胺、*N*-[[環丙甲氧基)胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氯苯基]亞甲基]苯乙醯胺、*N'*-[4-[4-氯-3-(三氟甲基)苯氧基]-2,5-二甲苯基]-*N*-乙基-*N*-甲基甲醯亞胺醯胺、1-[(2-丙烯硫基)羰基]-2-(1-甲基乙基)-4-(2-甲基苯基)-5-胺基-1*H*-吡唑-3-酮、*N*-[9-(二氟亞甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲橋基萘-5-yl]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-羧醯胺、3-(二氟甲基)-*N*-[9-(二氟亞甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲橋基萘-5-基]-1-甲基-1*H*-吡唑-4-羧醯胺、*N*-[9-(二溴亞甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲橋基萘-5-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-羧醯胺、*N*-[9-(二溴亞甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲橋基萘-5-基]-1-甲基-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-4-羧醯胺、*N*-[9-(二氟亞甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲橋基萘-5-基]-1-甲基-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-4-羧醯胺、*N*-[9-(二氯亞甲基)-1,2,3,4-四氫-1,4-甲橋基萘-5-基]-1-甲基-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-4-羧醯胺與

N'-[4-[[3-[(4-氯苯基)甲基]-1,2,4-噻二唑-5-基]氧基]-2,5-二甲苯基]-*N*-乙基-*N*-甲基-甲醯亞胺醯胺。

因此值得注意的混合物（即組成物）包含式 1 或式 1A 化合物與至少一種選自由前述種類(1)至(46)之殺真菌化合物。亦值得注意的組成物包含該混合物（以殺真菌有效量）並進一步包含至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑以及液體稀釋劑所組成之群組的額外組分。特別值得注意的混合物（即組成物）包含式 1 或式 1A 化合物與至少一種選自由與種類(1)至(46)有關之上列特定化合物。亦值得特別注意的組成物包含該混合物（以殺真菌有效量）並進一步包含至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑以及液體稀釋劑所組成之群組的額外界面活性劑。

其他可與本發明化合物配製的生物活性化合物或藥劑實例為：殺蟲劑如阿巴汀(abamectin)、毆殺松(acephate)、亞滅培(acetamiprid)、阿納寧(acrinathrin)、磺胺蟎酯(amidoflumet) (S-1955)、阿佛菌素(avermectin)、印楝素(azadirachtin)、谷速松(azinphos-methyl)、畢芬寧(bifenthrin)、聯苯腈酯(bifenazate)、布芬淨(buprofezin)、加保扶(carbofuran)、培丹(cartap)、剋安勃(chlorantraniliprole)、克凡派(chlorfenapyr)、克福隆(chlorfluazuron)、陶斯松(chlorpyrifos)、甲基陶斯松(chlorpyrifos-methyl)、可芬諾(chromafenozide)、可尼丁(clothianidin)、氰特破(cyantraniliprole) (3-溴-1-(3-氯-2-吡啶基)-*N*-[4-氰基-2-甲基-6-[(甲胺基)羰基]苯基]-1*H*-吡唑-5-羧醯胺)、賽芬

蟎(cyflumetofen)、賽扶寧(cyfluthrin)、貝他-賽扶寧(beta-cyfluthrin)、賽洛寧(cyhalothrin)、拉目達-賽洛寧(lambda-cyhalothrin)、賽滅寧(cypermethrin)、賽滅淨(cyromazine)、第滅寧(deltamethrin)、汰芬隆(diafenthion)、大利松(diazinon)、地特靈(dieldrin)、二福隆(diflubenzuron)、四氟甲醚菊酯(dimefluthrin)、大滅松(dimethoate)、達特南(dinotefuran)、苯蟲醚(diofenolan)、因滅汀(emamectin)、安殺番(endosulfan)、益化利(esfenvalerate)、乙蟲清(ethiprole)、芬硫克(fenothiocarb)、芬諾克(fenoxycarb)、芬普寧(fenpropathrin)、芬化利(fenvalerate)、芬普尼(fipronil)、氟尼胺(flonicamid)、氟蟲醯胺(flubendiamide)、護賽寧(flucythrinate)、陶-福化利(tau-fluvalinate)、嘮蟲胺(flufenerim)(UR-50701)、氟芬隆(flufenoxuron)、大福松(fonophos)、合芬隆(halofenozide)、六伏隆(hexaflumuron)、愛美松(hydramethylnon)、益達胺(imidacloprid)、因得克(indoxacarb)、亞芬松(isofenphos)、祿芬隆(lufenuron)、馬拉松(malathion)、氯氟醚菊酯(meperfluthrin)、美氟綜(metaflumizone)、滅蝸靈(metaldehyde)、達馬松(methamidophos)、滅大松(methidathion)、納乃保(methomyl)、美賜平(methoprene)、甲氧 DDT (methoxychlor)、滅芬諾(methoxyfenozide)、美特寧(metofluthrin)、倍脈心肱(milbemycin oxime)、亞素靈(monocrotophos)、菸鹼(nicotine)、烯啶蟲胺(nitenpyram)、尼殺賽(nithiazine)、諾伐隆(novaluron)、諾伏隆(noviflumuron)(XDE-007)、

毆殺滅(oxamyl)、巴拉松(parathion)、巴拉松-甲基(parathion-methyl)、百滅寧(permethrin)、福瑞松(phorate)、裕必松(phosalone)、益滅松(phosmet)、福賜米松(phosphamidon)、比加普(pirimicarb)、佈飛松(profenofos)、佈福靈(profluthrin)、派滅淨(pymetrozine)、派福羅(pyrafluprole)、除蟲菊精(pyrethrin)、啖蟲丙醚(pyridalyl)、披福貴(pyrifluquinazon)、披綠羅(pyriprole)、百利普芬(pyriproxyfen)、魚藤精(rotenone)、魚尼丁(ryanodine)、賜托拉(spinetoram)、賜諾殺(spinosad)、賜派芬(spirodiclofen)、螺甲蟊酯(spiromesifen) (BSN 2060)、螺蟲乙酯(spirotetramat)、賜殺羅(sulfoxaflor)、甲丙硫磷(sulprofos)、得芬諾(tebufenozide)、得福(teflubenzuron)、七氟菊酯(tefluthrin)、托福松(terbufos)、殺蟲畏(tetrachlorvinphos)、四甲氟菊酯(tetramethylfluthrin)、賽果培(thiacloprid)、賽速安(thiamethoxam)、硫敵克(thiodicarb)、殺蟲單(thiosultap-sodium)、脫芬瑞(tolfenpyrad)、泰滅寧(tralomethrin)、啞蚜威(triazamate)、三氯松(trichlorfon)與三福隆(triflumuron)；以及生物藥劑包括蟲生細菌(entomopathogenic bacteria)，例如蘇力菌鮎澤亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*)、蘇力菌庫斯塔克亞種(*Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*)與蘇力菌之經膠囊化德他內毒素(例如 Cellcap、MPV、MPVII)；蟲生真菌(entomopathogenic fungi)，例如綠殭菌(green muscardine fungus)；與昆蟲病原(entomopathogenic)病

毒，包括桿狀病毒 (baculovirus)、核多角體 (nucleopolyhedro) 病毒 (NPV) 如 HzNPV、AfNPV；以及顆粒體 (granulosis) 病毒 (GV) 如 CpGV。

本發明化合物及其組成物可應用於經過基因轉殖的植物，以表現對無脊椎動物害蟲有毒蛋白以對無脊椎害蟲表現毒性蛋白（如蘇力菌德他內毒素 (*Bacillus thuringiensis* delta-endotoxin)）。從外部施用的本發明殺真菌化合物之效果可能會與該表現的毒蛋白產生協同作用。

農業用保護劑（殺蟲劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、殺蟎劑、除草劑與生物劑）的一般參考文獻包括 *The Pesticide Manual*，第 13 版，C. D. S. Tomlin 編輯 British Crop Protection Council，Farnham，Surrey，U.K.，2003 及 *The BioPesticide Manual*，第 2 版，L. G. Copping 編輯，British Crop Protection Council，Farnham，Surrey，U.K.，2001。

對於其中使用一或多種這些各式混合伙伴藥劑的實施例而言，這些各式混合伙伴藥劑（總計）對式 1 或式 1A 化合物之重量比例典型為介於約 1:3000 與約 3000:1。值得注意的是介於約 1:300 至約 300:1 間之重量比例（例如介於約 1:30 至約 30:1 間之比例）。熟習該項技術者可經由簡單實驗，迅速決定活性成分達成所需生物活性範圍必要之生物有效量。顯然地，相較於單獨使用式 1 或式 1A 化合物所能防治的範圍，包括這些額外組分可能擴大對於病害的防治範圍。

在一些實例中，本發明化合物與其他生物上有效（特別是殺真菌）化合物或試劑（即活性成分）可造成大於相加(greater-than-additive)（即協同）的效果。理想總是降低活性成分於環境的排放量，同時確保有效之害蟲防治效果。理想之結合物施用率為使各殺真菌活性成分發揮連合作用，達到農業滿意之真菌防治度；在此施用率下，結合物可產生降低作物生產成本同時減少環境負荷之優點。

值得注意的組合物為式 1 或式 1A 化合物與至少一種其他殺真菌活性成分。值得特別注意的此一組合物為該其他殺真菌活性成分具有與式 1 或式 1A 化合物不同之作用位點。在特定實例中，結合之至少一其他殺真菌活性成分其控制範圍相仿，但具有不同作用位置，則在抗性管理方面尤具益處。因此，本發明組合物可進一步包含生物有效量之至少一額外殺真菌活性成分，此成分具有相仿防治範圍但不同作用位置。

特別值得注意的組成物，除了式 1 或式 1A 化合物以外尚包括至少一種選自由以下所組成之群組的化合物：(1)伸烷基雙(二硫胺甲酸酯)類殺真菌劑；(2)克絕；(3)苯基醯胺類殺真菌劑；(4)丙氧喹啉(6-碘-3-丙基-2-丙氧基-4(3*H*)-喹唑啉酮)；(5)四氯異苯腈；(6)羧醯胺，其作用在該真菌類粒線體呼吸電子傳遞位點的錯合物 II；(7)快諾芬；(8)滅芬農；(9)賽芬胺；(10)賽普洛；(11)銅化合物；(12)酞醯亞胺類殺真菌劑；(13)福賽得；(14)苯并咪唑類殺真菌劑；(15)賽座滅；(16)扶吉胺；(17)丙森鋅；(18)普拔克；(19)維利黴素(validomycin)；(20)

二氯苯基二羧亞醯胺類殺真菌劑；(21)座賽胺；(22)氟比來；(23)曼普胺；(24)羧酸醯胺，其作用在磷脂質生物合成與細胞壁沉積；(25)達滅芬；(26)非 DMI 固醇生物合成抑制劑；(27)在固醇生物合成中之去甲基酶抑制劑；(28) bc_1 錯合物類殺真菌劑；以及化合物(1)至(28)之鹽類。

下面提供殺真菌化合物分類的進一步敘述。

固醇生物合成抑制劑（第(27)群）藉由抑制在固醇生物合成路徑中的酵素來防治真菌。抑制去甲基酶的殺真菌劑在真菌的固醇生物合成路徑中具有一共同作用點，包含在羊毛甾醇或 24-亞甲基二氫羊毛甾醇（24-methylene dihydrolanosterol，真菌中的固醇前驅物）的位置 14 抑制去甲基作用。作用於該位點的化合物通常被稱為去甲基酶抑制劑、DMI 殺真菌劑或 DMI。該去甲基酶在生化文獻中有時會被稱作其他名稱，包括細胞色素 P-450 (14DM)。該去甲基酶係描述於例如 *J. Biol. Chem.* **1992**, 267, 13175-79 與其中所引用之參考文獻。DMI 殺真菌劑分為數種化學種類：唑類（包括三唑類以及咪唑類）、嘧啶類、哌【口+井】(piperazine)類以及吡啶類。該三唑類包括阿扎康唑(azaconazole)、溴克座(bromuconazole)、環克座(cyproconazole)、待克利(difenoconazole)、達克利(diniconazole)(包括達克利-M))、依普座(epoxiconazole)、乙環唑(etaconazole)、芬克座(fenbuconazole)、氟喹唑(flquinconazole)、護矽得(flusilazole)、護汰芬(flutriafol)、菲克利(hexaconazole)、易胺座(imibenconazole)、種菌唑(ipconazole)、滅特座

(metconazole)、邁克尼(myclobutanil)、平克座(penconazole)、普克利(propiconazole)、丙硫菌唑(prothioconazole)、奎因克座(quinconazole)、矽氟唑(simeconazole)、得克利(tebuconazole)、四克利(tetraconazole)、三泰芬(triadimefon)、甲三泰隆(triadimenol)、滅菌唑(triticonazole)及單克素(uniconazole)。該咪唑類包括克霉唑(clotrimazole)、益康唑(econazole)、依滅列(imazalil)、異康唑(isoconazole)、咪康唑(miconazole)、惡咪唑(oxpoconazole)、撲克拉(prochloraz)及賽福座(triflumizole)。該嘧啶類包括芬瑞莫(fenarimol)、尼瑞莫(nuarimol)及嘧菌醇(triarimol)。該哌【口+井】類包括賽福寧(triforine)。該吡啶類包括得滅多(buthiobate)及比芬諾(pyridifenox)。生化研究顯示以上所有殺真菌劑皆為 DMI 殺真菌劑，如 K. H. Kuck 等人於 *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*，H. Lyr 編輯，Gustav Fischer Verlag：New York，1995，205-258 所述。

bc_1 錯合物殺真菌劑（第 28 群）的殺真菌作用模式為抑制在粒線體呼吸鏈中的該 bc_1 錯合物。該 bc_1 錯合物在生化文獻中有時被稱為其他名稱，包括電子轉移鏈的錯合物 III，以及泛氫醌(ubihydroquinone)：細胞色素 *c* 氧化還原酶。此錯合物係特定標示為酵素委員會編號 (Enzyme Commission number) EC1.10.2.2。該 bc_1 錯合物係描述於例如 *J. Biol. Chem.* **1989**，264，14543-48；*Methods Enzymol.* **1986**，126，253-71；以及其中引用之

參考文獻。已知具有該作用模式的有嗜球果傘素類殺真菌劑，例如亞托敏(azoxystrobin)、醚菌胺(dimoxystrobin)、烯肟菌酯(enestroburin (SYP-Z071))、氟嘧菌酯(fluxastrobin)、克收欣(kresoxim-methyl)、苯氧菌胺(metominostrobin)、肟醚菌胺(orysastrobin)、啖氧菌酯(picoxystrobin)、百克敏(pyraclostrobin)、唑胺菌酯(pyrametostrobin)、唑菌酯(pyraoxystrobin)及三氟敏(trifloxystrobin) (H. Sauter et al., *Angew. Int. Ed.* **1999**, 38, 1328-1349)。其他在粒線體呼吸鏈中抑制 bc_1 錯合物的殺真菌化合物包括凡殺同(famoxadone)及咪唑菌酮(fenamidone)。

伸烷基雙(二硫胺甲酸酯)類(第(1)群)包括化合物如鋅錳乃浦(mancozeb)、錳乃浦(maneb)、甲基鋅乃浦(propineb)及鋅乃浦(zineb)。苯醯胺類(第(3)群)包括化合物如滅達樂(metalaxyl)、本達樂(benalaxyl)、霜靈(furalaxyl)及毆殺斯(oxadixyl)。羧醯胺類(第(6)群)包括化合物如白克列(boscalid)、萎鏽靈(carboxin)、甲呋醯胺(fenfuram)、福多寧(flutolanil)、福拉比(furametpyr)、滅普寧(mepronil)、嘉保信(oxycarboxin)、賽氣滅(thifluzamide)、吡噻菌胺(penthiopyrad)及 N -[2-(1,3-二甲基丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-羧醯胺(PCT 專利公開號 WO 2003/010149 號)，並已知可藉由擾亂呼吸電子轉移鏈中的錯合物 II(琥珀酸脫氫酶)以抑制粒線體功能。銅類化合物(第(11)群)包括化合物如氯氧化銅、硫酸銅及氫氧化銅，包括組成物如波多混合液(三元硫酸銅)。酞醯亞胺類(第(12)

群) 包括化合物如福爾培(folpet)及蓋普丹(captan)。苯并咪唑類殺真菌劑(第(14)群)包括免賴得(benomyl)及貝芬替(carbendazim)。二氯苯基二羧亞醯胺類殺真菌劑(第(20)群)包括克氯得(chlozolate)、菌核利(dichlozoline)、依普同(iprodione)、愛瓦同(isovaledione)、甲菌利(myclozolin)、撲滅寧(procymidone)及免克寧(vinclozolin)。

非 DMI 固醇生物合成抑制劑(第(26)群)包括嗎啉類和哌啶類殺真菌劑。該嗎啉類及哌啶類為固醇生物合成抑制劑,其已知能抑制固醇生物合成路徑中的步驟,時點比由 DMI 固醇生物合成(第(27)群)所達成的抑制稍晚。該嗎啉類包括愛地福(alldimorph)、十二環嗎啉(dodemorph)、芬普福(fenpropimorph)、三得芬(tridemorph)以及三芬醯胺(trimorphamide)。該哌啶類包括苯鏽啉(fenpropidin)。

值得進一步注意的是式 1 或式 1A 化合物與以下之組合物:亞托敏、克收欣、三氟敏、百克敏、啞氧菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺、貝芬替、四氯異苯腈、快諾芬、滅芬農、賽芬胺、苯鏽啉(fenpropidine)、芬普福、溴克座、環克座、待克利、依普座、芬克座、護矽得、菲克利、種菌唑、滅特座、平克座、普克利、丙氧喹啉、丙硫菌唑、得克利、滅菌唑、凡殺同、撲克拉、吡噻菌胺與白克列(啞醯菌胺(nicobifen))。

尤為較佳之混合物(化合物編號係指以下索引表 A 至 C 中之化合物)係選自以下群組:亞托敏與下列化合物之組合物:化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合

物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；克收欣與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；三氟敏與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；啖氧菌酯與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物

42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；苯氧菌胺與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；快諾芬與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；滅芬農與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合

物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；苯鏽啉與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；芬普福與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；環克座與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；依普座與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、

化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；護矽得與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；減特座與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；普克利與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物

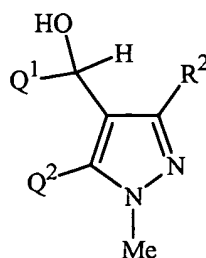
42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；丙氧喹啉與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；丙硫菌唑與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；得克利與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合

物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；滅菌唑與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；凡殺同與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；吡噻菌胺與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；3-(二氟甲基)-1-甲基-N-(3',4',5'-三氟[1,1'-聯苯]-2-基)-1*H*-吡唑-4-羧醯

胺與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；5-乙基-6-辛基-[1,2,4]三唑[1,5-a]嘧啶-7-胺與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179；以及 Initium®與下列化合物之組合物：化合物 3、化合物 10、化合物 12、化合物 14、化合物 17、化合物 18、化合物 19、化合物 21、化合物 30、化合物 31、化合物 33、化合物 36、化合物 37、化合物 40、化合物 42、化合物 45、化合物 61、化合物 69、化合物 80、化合物 82、化合物 85、化合物 90、化合物 97、化合物 112、化合物 119、化合物 120、化合物 126、化合物 137、化合物 142、化合物 157、化合物 160 或化合物 179。

下表 A 係展現本發明之化合物對於特定病原體之防治效力。該些化合物所提供之病原體防治保護然而不限於這些物種（即下列測試 A 至 F 所述之物種）。該些化合物之描述係提供於下列索引表 A 至 C 中。下列縮寫係用於指索引表：Me 為甲基，MeO 為甲氧基，EtO 為乙氧基，CN 為氰基，NO₂ 為胺基並且 Ph 為苯基。縮寫「Cmpd. No.」係指化合物編號，並且「Ex.」表示「實例」並且依照指示製備化合物之合成實例的編號編排。質譜(MS)係記述為最高同位素豐度母離子(M+1)之分子量，其係藉由將 H⁺(分子量為 1)加入至該分子而形成，藉由使用大氣壓力化學離子化(AP⁺)的質譜測定法測定。

索引表 A



Cmpd. No.	R ²	Q ¹	Q ²	m.p. (°C)	AP+ (M+1)
3	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph		383
9	Cl	2,4-二-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph	104-107	
10	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph	142-144	
14 (Ex. 4)	Me	2,4-二-F-Ph	2,6-二-F-Ph	**	**
15	Me	2,4,6-三-F-Ph	2,6-二-F-Ph		369
16	Me	2,6-二-F, 4-MeO-Ph	2,6-二-F-Ph		381

Cmpd. No.	R ²	Q ¹	Q ²	m.p. (°C)	AP+ (M+1)
17	Me	2,4-二-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph		367
18	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph		383
19	Me	2,4,6-三-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph		385
20	Me	2,6-二-F, 4-MeO-Ph	2-Cl、4-F-Ph		397
21	Me	2-Br、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph		411
22	Me	2-F、4-CN-Ph	2,6-二-F-Ph	*	*
23	Me	2-Br、4-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph		429
25	Me	2-F、4-CN-Ph	2-Cl、4-F-Ph		374
30 (Ex. 9)	Br	2,4-二-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph	**	**
33	Me	2,4-二-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph		367
34	Me	2,4,6-三-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph		385
37	Me	2-Br、4-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph		427
38	Me	4-CN、2-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph		374
39	Me	2,6-二-F, 4-MeO-Ph	2-Cl、6-F-Ph		397
53 (Ex. 11)	CN	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph	**	**
55	Me	2,4,6-三-Cl-Ph	2-Cl、6-F-Ph		435
61	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,4,6-三-F-Ph		385
66	Me	2,4-二-F-Ph	2,4,6-三-F-Ph		369
69	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-Cl-Ph	160-162	
70	Me	2,4,6-三-F-Ph	2,6-二-Cl-Ph	137-139	
71	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,4-二-F-Ph	*	*
72 (Ex. 8)	Me	2,4-二-F-Ph	2,4-二-F-Ph	**	**
74	Me	2,4-二-F-Ph	2,6-二-Cl-Ph	125-128	
76	Me	2,4-二-F-Ph	2-Br、4-F-Ph		411
77	Me	4-Cl-Ph	2,6-二-Cl-Ph		383
79 附註 1	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-Br		411
80 附註 2	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-Br		411
82	Me	2,4,6-三-F-Ph	2-Br、4-F-Ph	*	*
85	Me	2,6-二-Cl-Ph	2-Cl、6-F-Ph		399
86 附註 3	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph	61-71	
87 附註 4	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph		367

Cmpd. No.	R ²	Q ¹	Q ²	m.p. (°C)	AP+ (M+1)
88	Me	2-Br、4-F-Ph	2-I		503
90	Me	2,4-二-Cl-Ph	2-Cl、6-F-Ph		401
94	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-Br、6-F-Ph		429
95	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-Br、4-F-Ph	*	*
97	Me	2,4-二-F-Ph	2,4-二-Cl-Ph	123-127	
98	Me	2-Cl、4-F-Ph	3,5-二-Cl-4-吡啶基		400
99	Me	2-I、4-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph		475
100	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,4-二-Cl-Ph		401
101	Me	4-Cl、2-F-Ph	2,4-二-Cl-Ph	150-152	
103 附註 3	Me	2-Cl、4-F-Ph	4-F、2-I-Ph	148-151	
104 附註 4	Me	2-Cl、4-F-Ph	4-F、2-I-Ph		475
105	Me	2-Cl、4-F-Ph	4-F-Ph	349	
106	Me	2,4-二-F-Ph	4-Br-2,6-二-4-F-Ph		431
112	Me	2,4-二-F-Ph	4-CN-2,6-二-4-F-Ph	170-173	
113	Br	2-Br、4-F-Ph	2,6-二-4-F-Ph	118-120	
114	Br	2,4,6-三-F-Ph	2,6-二-4-F-Ph	168-170	
117	Cl	2,4-二-F-Ph	2,6-二-4-F-Ph	97-99	
118	MeO	2-Cl、4-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph		399
119	Br	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-4-F-Ph	83-86	
120	MeO	2-Cl、4-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph		399
124	Br	2,4-二-F-Ph	2,6-二-F-Ph	80-82	
125	Br	2-Cl、4-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph	142-144	
126	MeO	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph		383
127	EtO	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph		397
128	F ₂ CHO	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph		419
129	Me	2-Me、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph		347
130	H	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph	136-138	
131	Br	2,4-二-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph	143-146	
132	Br	2-Br、4-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph	122-125	
133	Cl	2,4-二-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph	157-160	
134	Cl	2-Br、4-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph	117-120	

Cmpd. No.	R ²	Q ¹	Q ²	m.p. (°C)	AP+ (M+1)
135	Cl	2-Cl、4-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph	131-134	
136	Cl	2-Br、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph	100-102	
137	Cl	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph	113-115	
138	MeO	2,3,6-三-F-Ph	2,6-二-F-Ph		385
139	MeO	2-Cl、3,6-二-F-Ph	2,6-二-F-Ph		400
140	MeO	2-Me、4-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph		379
141	MeO	2-Cl、4-F-Ph	2-Cl、4,6-二-F-Ph		417
142	MeO	2-Cl、4-MeO-Ph	2-Cl、6-F-Ph		411
143	MeO	2-F、4-MeO-Ph	2-Cl、6-F-Ph		395
144	MeO	2-Cl、3,6-二-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph		417
145	MeO	2,3,6-三-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph		401
146	Me	2,4-二-F-Ph	2-Me-1 <i>H</i> -咪唑-1-基	180-183	
147	Me	2-Me、4-F-Ph	2-Me-1 <i>H</i> -咪唑-1-基		
148	Br	2-Cl、4-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph	131-134	
149	Br	2-Me、4-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph	133-136	
150	Me	2-Me、4-F-Ph	2-Cl-1 <i>H</i> -咪唑-1-基	165-168	
151	Me	2,4-二-F-Ph	2-Cl-1 <i>H</i> -咪唑-1-基	183-186	
152	MeO	2-Cl、4-F-Ph	2,4,6-F-Ph		401
153	MeO	2,4-二-F-Ph	2,4,6-三-F-Ph		385
154	MeO	2-F-Ph	2,4,6-三-F-Ph		365
155	MeO	2-Cl、6-F-Ph	2,4,6-三-F-Ph		401
156	MeO	2,4-二-F-Ph	2,6-二-F-Ph		367
157 (Ex. 12)	MeO	2-Me、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph	**	**
158	Me	2-Me 4-F-Ph	3,5-二-Me-1 <i>H</i> -吡唑-1-基	97-99	
159	Me	2,4-二-F-Ph	3,5-二-Me-1 <i>H</i> -吡唑-1-基	136-138	
160	MeO	2-Cl、4-MeO-Ph	2,6-二-F-Ph		365
161	MeO	2-F、4-MeO-Ph	2,6-二-F-Ph		379
162	MeO	2-Cl、4-F-Ph	4-Cl、2,6-二-F-Ph		417
163	Br	2,4-二-Cl-Ph	2,6-二-F-Ph	174-176	
164	Br	2-Br、4-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph	148-150	

Cmpd. No.	R ²	Q ¹	Q ²	m.p. (°C)	AP+ (M+1)
165	Br	2-Me、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph	85-87	
166	Me	2-Cl、4-F-Ph	3,5-二-F-4-吡啶基	*	*
167	Me	2,4-二-F-Ph	3,5-二-Cl-4-吡啶基	*	*
168	Me	2,4-二-F-Ph	3,5-二-F-4-吡啶基		352
169	Me	2-Cl、4-MeO-Ph	2-Cl、4-F-Ph		395
170	Me	2-Cl、4-MeO-Ph	2-Cl、6-F-Ph		395
171	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-F、4-MeO-Ph		397
172	Me	2,4-二-F-Ph	2,6-二-F、4-MeO-Ph		381
173	Me	2,4,6-三-F-Ph	2,6-二-F、4-MeO-Ph		399

* 請見索引表 D 以取得 ¹H NMR data 之數據。

** 請見合成實例以取得 ¹H NMR。

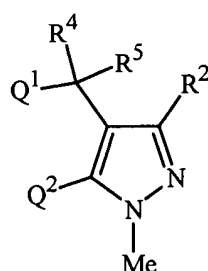
附註 1：99%鏡像異構物 A。

附註 2：87%鏡像異構物 B，13%鏡像異構物 A。

附註 3：鏡像異構物 A。

附註 4：鏡像異構物 B。

索引表 B

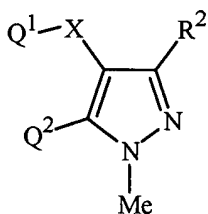


Cmpd. No.	R ²	Q ¹	Q ²	R ⁴	R ⁵	AP+ (M+1)
29	Me	2,4-二-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph	OH	Me	381
54	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph	F	H	369

Cmpd. No.	R ²	Q ¹	Q ²	R ⁴	R ⁵	AP+ (M+1)
67	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph	MeO	H	397
68 (Ex. 5)	Me	2,4-二-F-Ph	2,6-二-F-Ph	F	H	**
75	Me	2,4,6-三-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph	F	H	387
84	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph	Cl	H	383
92	Me	2,4-二-Cl-Ph	2,6-二-F-Ph	F	H	384
107	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-4-F-Ph	N≡CCH ₂ O	H	406
108	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-4-F-Ph	CH ₃ C(=O)O	H	409
109	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-4-F-Ph	CH ₂ =CHCH ₂ O	H	407
110	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-4-F-Ph	CH ₃ OCH ₂ O	H	411
111	Me	2-Cl、4-F	2,6-二-4-F-Ph	N≡CS	H	408
115	Me	2,4-二-F-Ph	2,6-二-4-F-Ph	N≡CS	H	392
116	Me	2,4,6-三-F-Ph	2,6-二-4-F-Ph	N≡CS	H	410
121	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph	N≡CS	H	424
122	Me	2,4-二-4-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph	N≡CS	H	408
123	Me	2,4,6-三-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph	N≡CS	H	426

** 請見合成實例以取得 ¹H NMR。

索引表 C



Cmpd. No.	R ²	Q ¹	Q ²	X	m.p. (°C)	AP+ (M+1)
1	Me	4-F-Ph	2,4-二-F-Ph	O	39-40	
2	Me	4-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph	O	71-73	
4	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph	O		369
5 (Ex. 3)	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,4-二-F-Ph	O	**	**

Cmpd. No.	R ²	Q ¹	Q ²	X	m.p. (°C)	AP+ (M+1)
6	Me	4-CN、2-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph	O	126-128	
7	Me	4-CN、2-F-Ph	2,4-二-F-Ph	O	131-133	
8	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-F、4-CN-Ph	O	139-141	
11	Me	2,4-二-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph	O		353
12	Me	2,4-二-F-Ph	2-Cl、4-MeO-Ph	O		356
13	Me	2,4-二-F-Ph	2,4-二-F-Ph	O	62-64	
24	Me	2,4-二-F-Ph	2,6-二-F-Ph	C(=O)		349
26	Me	2,4-二-F-Ph	2-F、4-CN-Ph	O	125-127	
27	Me	2,4-二-Cl-Ph	2-Cl、6-F-Ph	C(=O)		399
28	Me	2,4-二-F-Ph	2-Cl、6-F-Ph	C(=O)		365
31	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-Cl、4-MeO-Ph	O		381
32 (Ex. 7)	Me	2,4-二-F-Ph	2,4-二-F-Ph	C(=O)	**	**
35	Me	2-Cl、4-CN-Ph	2,4-二-F-Ph	O	132-134	
36	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-Cl、4-CN-Ph	O	123-125	
40 (Ex. 1)	Me	4-CN、2,6-二-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph	NH	**	**
41	Me	4-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph	NH		334
42	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph	NH		369
43	Me	2-Cl、4-CN-Ph	2-Cl、4-F-Ph	O	133-135	
44	Me	2,4-二-Cl-Ph	2-Cl、4-F-Ph	NH		384
45 (Ex. 2)	Me	4-Cl、2-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph	NH	**	**
46	Me	2,6-二-Cl-Ph	2-Cl、6-F-Ph	C(=O)		397
47	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph	C(=O)		365
48	Br	2,4-二-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph	C(=O)	154-156	
49	Me	2,4-二-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph	NH		352
50	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph	NH		352
51	Me	2,4,6-三-Cl	2-Cl、6-F-Ph	C(=O)		433
52 (Ex. 10)	CN	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-F-Ph	C(=O)	**	**
56 (Ex. 6)	Me	4-Cl-Ph	2,6-二-F-Ph	S	**	**
57	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,4-二-F-Ph	NH		352
58	Me	2-Br、4-F-Ph	2-Cl、4-F-Ph	NH		412
59	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,4,6-三-F-Ph	C(=O)		383

Cmpd. No.	R ²	Q ¹	Q ²	X	m.p. (°C)	AP+ (M+1)
60	Me	2,4-二-F-Ph	2,4,6-三-F-Ph	C(=O)	*	*
62	Me	4-Cl-Ph	2,6-二-F-Ph	S(=O) ₂		383
63	Me	4-Cl-Ph	2,6-二-F-Ph	S(=O)		367
64	Me	2,4-二-F-Ph	2,6-二-F-Ph	NH		336
65	Me	2,4-二-Cl	2,4-二-F-Ph	NH		368
73	Me	2,4-二-F-Ph	2-Br、4-F-Ph	C(=O)		409
78	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-Br-Ph	C(=O)		409
81	Me	2-Br、4-F-Ph	2-I-Ph	C(=O)		501
83	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-Br、4-F-Ph	C(=O)	*	*
89	Me	2,4-二-F-Ph	2,4-二-Cl-Ph	C(=O)		381
91	Me	2-Cl、4-F-Ph	2,6-二-Cl-Ph	N(OH)		384
93	Me	2-Cl、4-F-Ph	2-Br、6-F-Ph	C(=O)		427
96	Me	2-Cl、4-F-Ph	3,5-二-Cl-4-吡啶基	C(=O)		398
102	Me	2,4-二-F-Ph	2,6-二-F、4-Br-Ph	C(=O)		429

* 請見索引表 D 以取得 ¹H NMR 數據。

** 請見合成實例以取得 ¹H NMR。

索引表 D

Compd. No.	¹ H NMR 數據 (CDCl ₃ 溶液) ^a
22	δ 7.57 (t, 1H), 7.45-7.36 (m, 1H), 7.28-7.24 (m, 1H), 7.16-7.11 (m, 1H), 7.02-6.98 (m, 1H), 6.86-6.82 (m, 1H), 5.88 (d, 1H), 3.60 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 2.2 (br s, 1H).
60	δ 7.42-7.36 (m, 1H), 6.82-6.76 (m, 1H), 6.62-6.50 (m, 3H), 3.69 (s, 3H), 2.46 (s, 3H).
71	δ 7.55-7.35 (m, 1H), 7.28-6.69 (m, 5H), 5.78 (d, 1H), 3.51 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 2.2 (br s, 1H).
82	δ 7.26-7.15 (m, 2H), 7.0-7.12 (m, 1H), 6.40 (m, 2H), 6.0 (d, 1H), 3.46 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.42 (br s, 1H).
83	δ 7.26-7.12 (m, 3H), 6.94 (m, 1H), 6.85 (dd, 1H), 6.78-6.70 (m, 1H), 3.57 (s, 3H), 2.49 (s, 3H), 2.2 (br s, 1H).
95	δ 7.38-7.27 (m, 2H), 6.97-6.92 (m, 1H), 6.82-6.78 (m, 1H), 6.68-6.61 (m, 2H), 5.88 (d, 1H), 3.46 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 2.2 (br s, 1H).

Compd. No.	¹ H NMR 數據 (CDCl ₃ 溶液) ^a
166	δ 8.37-8.28 (m, 2H), 7.43 (m, 1H), 6.91 (m, 1H), 6.74 (m, 1H), 5.84 (m, 1H), 3.57 (s, 3H), 2.38 (m, 1H), 2.20 (s, 3H).
167	δ 8.69 (s, 1H), 8.67 (s, 1H), 7.42 (m, 1H), 6.79 (m, 1H), 6.68 (m, 1H), 5.87 (m, 1H), 3.66 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.08 (m, 1H).

^a ¹H NMR 數據係偏離自四甲基矽烷的低場 ppm。偶合係以下列標示：
(s)-單峰，(d)-雙重峰，(t)-三重峰，(m)-多重峰，(dd)-雙重峰的雙重峰
以及(br s)-寬單峰。

本發明生物實例

用於製備測試 A 至 F 之測試懸浮液的通用方法：
先將測試化合物以相當於最終體積 3% 的量溶於丙酮，
接著以所欲濃度（單位為 ppm）懸浮在含 250 ppm 界面
活性劑 Trem[®] 014（多元醇酯）之丙酮和純水（以 50/50
體積混合）中。而後將所得測試懸浮液用於測試 A 至 F
中。噴灑 200 ppm 的測試懸浮液於測試植物上直到溢流
程度，其相當於 800 g/ha 的施用率。除非另有指明，評
值所指係使用 200 ppm 測試懸浮液。（評值旁的星號「*」
代表使用 40 ppm 測試懸浮液。）

測試 A

將測試懸浮液噴灑於番茄苗至溢流為止。於第二天
將灰黴病菌(*Botrytis cinerea*)（番茄灰黴病的致病劑）
孢子懸浮液接種於幼苗，於 20°C 飽和蒸氣壓下培養 48
小時，接著移至 24°C 生長箱中放置 3 天，在此時間後，
進行外觀疾病評級。

測試 B

將測試懸浮液噴灑於番茄苗至溢流為止。於第二天將早疫病菌(*Alternaria solani*) (番茄早疫病的致病劑) 孢子懸浮液接種於植苗，於 27°C 飽和蒸氣壓下培養 48 小時，接著移至 20°C 生長箱中放置 5 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

測試 C

將測試懸浮液噴灑於小麥苗至溢流為止。於第二天將小麥穎枯病菌(*Septoria nodorum*) (小麥穎枯病的致病劑) 孢子懸浮液接種於幼苗，於 24°C 飽和蒸氣壓下培養 48 小時，接著移至 20°C 生長箱中放置 6 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

測試 D

將測試懸浮液噴灑於小麥苗至溢流為止。於第二天將小麥葉斑病菌(*Septoria tritici*) (小麥葉斑病的致病劑) 孢子懸浮液接種於幼苗，於 24°C 飽和蒸氣壓下培養 48 小時，接著移至 20°C 生長箱中放置 19 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

測試 E1

將小麥葉鏽病菌(*Puccinia recondita* f. sp. *tritici*) (小麥葉鏽病的致病劑) 孢子懸浮液接種於小麥苗，於 20°C 飽和蒸氣壓下培養 24 小時，接著移至 20°C 生長箱中放置 2 天。在 2 天後，將測試懸浮液噴灑至溢流為止，

接著將幼苗移回至 20°C 生長箱中放置 6 天。在移出時，進行外觀疾病評級。

測試 E2

將測試懸浮液噴灑於小麥苗至溢流為止。於第二天將小麥葉鏽病菌(*Puccinia recondita* f. sp. *tritici*) (小麥葉鏽病的致病劑) 孢子懸浮液接種於幼苗，於 20°C 飽和蒸氣壓下培養 24 小時，接著移至 20°C 生長箱中放置 7 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

測試 F

將測試懸浮液噴灑於小麥苗至溢流為止。於第二天將小麥白粉病菌(*Blumeria graminis* f. sp. *tritici*) (亦已知為小麥布氏白粉病菌(*Erysiphe graminis* f. sp. *tritici*), 小麥白粉病之致病劑) 接種於幼苗，於 20°C 生長箱中培養 8 天，在此時間後，進行外觀疾病評級。

測試 A-F 之結果係示於表 A 中。表中，等級 100 表示 100% 疾病防治，而等級 0 表示無疾病防治效果(相對於對照組)。破折號(-)代表無測試結果。評值旁的星號「*」代表使用 40 ppm 測試懸浮液。

表 A

Cmpd. No	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E1	測試 E2	測試 F
1	100	0	0	0	38	68	91
2	100	0	0	100	77	97	99
3	100	100	100	100	99	100	100
4	98	0	0	100	75	98	97

Cmpd. No	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E1	測試 E2	測試 F
5	87	0	0	97	23	92	66
6	100	59	0	100	0	99	100
7	0	96	0	100	0	9	0
8	100	0	0	99	0	40	99
9	100	0	0	100	100	100	99
10	100	100	99	100	98	100	100
11	100	0	0	95	91	97	96
12	100	93	0	100	65	89	98
13	100	0	0	0	66	0	72
14	100	100	99	100	96	100	100
15	100	100	86	100	68	100	100
16	100	99	0	100	54	100	93
17	100	94	60	100	83	100	100
18	100	83	0	100	100	100	100
19	99	100	100	100	100	100	100
20	97*	97*	0*	100*	99*	99*	92*
21	99	100	100	100	100	100	98
22	88	84	0	100	17	88	0
23	100	67	87	100	98	100	84
24	9	0	0	0	9	79	96
25	100	99	89	100	9	100	96
26	100	0	0	-	0	79	64
27	0	0	0	0	0	0	81
28	56	0	0	0	0	8	79
29	100	64	0	-	0	100	96
30	100	9	0	100	100	99	99
31	100	0	0	100	0	92	96
32	26	0	0	-	0	0	0
33	100	100	100	100	99	100	100
34	100	99	100	100	84	99	100
35	98	0	0	100	9	73	0
36	96	0	0	100	18	100	100
37	100	99	100	100		100	100
38	85	99	100	100	0	100	98
39	95	58	60	100	97	100	99

Cmpd. No	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E1	測試 E2	測試 F
40	100	99	99	100	91	100	100
41	100	64	0	98	0	41	0
42	99	99	0	100	32	99	100
43	98	0	0	100	0	98	97
44	99*	0*	0*	99*	0*	99*	100*
45	98*	33*	0*	100*	0*	95*	100*
46	-	-	-	-	-	-	-
47	-	-	-	-	-	-	-
48	26	0	0	99	-	0	0
49	100*	0*	0*	96*	-	74*	87*
50	99	93	0	100	0	79	98
51	-	-	-	-	-	-	-
52	-	-	-	-	-	-	-
53	93*	99*	0*	100*	0*	93*	43*
54	100	100	99	100	100	99	99
55	99	97	78	100	99	100	95
56	0	0	0	0	60	27	97
57	99*	0*	0*	81*	0*	18*	97*
58	100*	8*	0*	100*	0*	98*	97*
59	66	0	0	58	0	80	100
60	75	0	0	0	0	55	99
61	100	100	99	100	99	100	100
62	0	0	0	0	0	28	94
63	0	0	0	0	0	28	76
64	99	0	0	48	0	55	97
65	100	0	0	100	9	89	100
66	100	100	95	100	55	100	99
67	57	9	0	100	28	90	100
68	100	88	99	100	100	100	100
69	99	100	96	100	0	99	97
70	-	99	60	100	94	100	99
71	-	78*	73*	100*	88*	99*	99*
72	-	53*	0*	100*	18*	96*	98*
73	-	60*	0*	14*	0*	0*	34*
74	-	100	92	99	0	99	98

Cmpd. No	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E1	測試 E2	測試 F
75	-	100*	87*	100*	74*	100*	99*
76	-	99	60	100	99	100	100
77	-	93	0	99	0	79	89
78	0	31	40	0	0	79	99
79	98	0	0	100	53	100	99
80	99	97	69	100	99	99	99
81	54	46	0	0	-	0	99
82	99	100	92	99	27	100	100
83	55*	0*	0*	25*	0*	74*	99*
84	96*	100*	99*	100*	41*	100*	100*
85	97	84	0	100	9	100	50
86	99	100*	99*	100	99*	100	100
87	100	0*	100	99*	0*	99	99
88	-	0	0	99	0	68	89
89	-	0	0	93	0	89	100
90	-	100*	99*	100*	74*	100*	100
91	-	0	0	100	0	68	99
92	-	99*	94*	100*	74*	99*	100*
93	90	-	-	7	-	91	100
94	99	-	-	100	-	100	100
95	94*	-	-	99*	-	98*	95*
96	60*	0*	0*	0*	-	0*	26*
97	99	-	-	100	-	100	99
98	94*	-	-	100*	-	100*	100*
99	97	-	-	100	-	100	99
100	-	-	-	100	-	100	99
101	-	-	-	100	-	99	72
102	0	-	-	0	-	55	97
103	99	-	-	98	-	96	95
104	0*	-	-	98*	-	97*	72*
105	0*	-	-	100*	-	98*	81*
106	98	-	-	100	-	97	0
107	9*	-	-	99*	-	99*	99*
108	99*	-	-	100*	-	100*	100*
109	0*	-	-	100*	-	98*	97*

Cmpd. No	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E1	測試 E2	測試 F
110	0*	-	-	100*	-	98*	99*
111	100	-	-	100	-	100	100
112	80	-	-	100	-	100	97
113	99	-	-	100	-	100	100
114	21	-	-	100	-	98	98
115	88*	-	-	100*	-	94*	99*
116	0*	-	-	78*	-	9*	0*
117	100	-	-	100	-	100	100
118	100	-	-	100	-	99	100
119	100	-	-	100	-	100	100
120	100	-	-	100	-	100	100
121	97*	-	-	100*	-	100*	100*
122	98*	-	-	100*	-	100*	99*
123	87*	-	-	100*	-	99*	90*
124	99	-	-	100	-	100	100
125	82	-	-	100	-	100	87
126	100	-	-	100	-	100	100
127	76	-	-	100	-	91	99
128	43*	-	0*	100*	-	85*	56*
129	100	-	-	100	-	99	100
130	100	-	-	100	-	100	100
131	98	-	-	100	-	100	98
132	0	-	-	100*	-	99*	100
133	100	-	-	100	-	100	99
134	100	-	-	100	-	100	99
135	100	-	-	100	-	100	99
136	100	-	-	100	-	100	100
137	100	-	-	100	-	100	100
138	66*	-	-	16*	-	55*	93*
139	83*	-	-	100*	-	80*	96*
140	100*	-	99*	100*	-	99*	100*
141	100*	-	97*	100*	-	99*	99*
142	100*	-	60*	100*	-	100*	100*
143	100*	-	0*	100*	-	99*	98*
144	78*	-	0*	100*	-	100*	98*

Cmpd. No	測試 A	測試 B	測試 C	測試 D	測試 E1	測試 E2	測試 F
145	26*	-	0*	35*	-	82*	73*
146	0	-	-	18	-	17	0
147	0*	-	-	0*	-	17*	0*
148	100	-	-	100	-	100	99
149	100	-	-	100	-	100	100
150	8	-	-	0	-	9	0
151	16	-	-	0	-	99	43
152	100*	-	-	100*	-	100*	100*
153	100*	-	-	100*	-	100*	100*
154	100	-	-	100	-	100	100
155	99*	-	-	100*	-	100*	99*
156	100*	-	-	100*	-	99*	99*
157	100*	-	-	100*	-	100*	100*
158	0	-	-	8	-	0	13
159	0	-	-	0	-	0	0
160	95*	-	-	100*	-	100*	98*
161	94*	-	-	100*	-	92*	90*
162	99*	-	-	100*	-	86*	64*
163	100	-	-	100	-	100	98
164	100	-	-	100	-	100	0
165	100	-	-	100	-	100	100
166	99*	-	-	100*	-	99*	93*
167	0*	-	-	58*	-	0*	0*
168	21*	-	-	100*	-	88*	100*
169	0*	-	-	68*	-	88*	0*
170	100*	-	-	100*	-	100*	98*
171	100*	-	-	100*	-	100*	89*
172	99*	-	-	100*	-	100*	100*
173	87*	-	-	100*	-	100*	95*

201245155

【圖式簡單說明】

無

【主要元件符號說明】

無

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：100/30635

※申請日：100.8.26

※IPC 分類：C07D 231/38(2006.01)

A01N 43/56(2006.01)

A01P 3/00(2006.01)

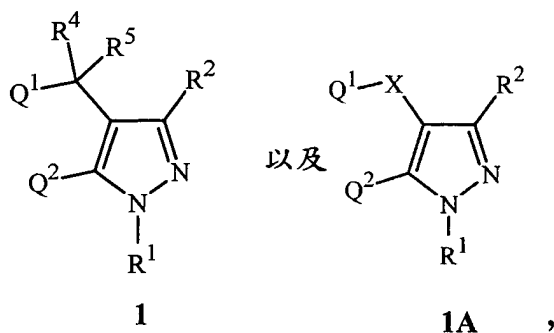
一、發明名稱：(中文/英文)

殺真菌吡唑

FUNGICIDAL PYRAZOLES

二、中文發明摘要：

所揭露者為式 1 與式 1A 化合物，包括所有立體異構物、其 N-氧化物及其鹽類，



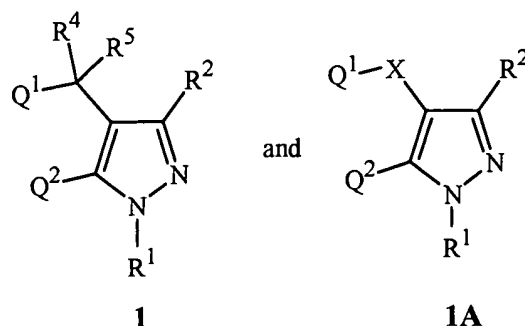
其中

Q^1 、 Q^2 、 R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 與 X 係如本揭露中所定義。

亦揭露者為含有式 1 或式 1A 化合物之組成物與用於防治由真菌類植物病原體造成之植物病害的方法，其包含施予一般真菌有效量之本發明化合物或組成物。

三、英文發明摘要：

Disclosed are compounds of Formula 1 and Formula 1A including all stereoisomers, *N*-oxides, and salts thereof,



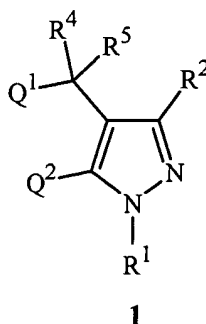
wherein

Q^1 , Q^2 , R^1 , R^2 , R^4 , R^5 and X are as defined in the disclosure.

Also disclosed are compositions containing the compounds of Formula 1 or Formula 1A and methods for controlling plant disease caused by a fungal pathogen comprising applying an effective amount of a compound or a composition of the invention.

七、申請專利範圍：

1. 一種選自式 1、其 *N*-氧化物及其鹽類的化合物，



其中

Q^1 為一經 1 至 5 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；

Q^2 為一經 1 至 5 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；

或一 5 至 6 員完全不飽和之雜環，各環含有選自碳原子與 1 至 3 個雜原子之環員，該雜原子係獨立選自至多 2 個 O、至多 2 個 S 與至多 3 個 N 原子，其中至多 2 個碳環員係獨立選自 C(=O) 與 C(=S)，各環係選擇性地經至多 5 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} 的取代基取代；

R^1 為 C_1 - C_2 烷基、鹵甲基、氰甲基或環丙基；

R^2 為 H、鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_2 - C_3 氰烷基、 C_1 - C_2 羥烷基、環丙基、鹵環丙基、 C_2 - C_3 烷氧烷基、 C_1 - C_2 烷硫基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、羥基、硝基、胺基、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_3 - C_6

環烷基、C₃-C₆ 鹵環烷基、C₄-C₆ 烷環烷基、C₄-C₆ 環烷烷基、C₁-C₃ 烷硫基、C₁-C₃ 鹵烷硫基、C₁-C₃ 烷亞磺基、C₁-C₃ 鹵烷亞磺基、C₁-C₃ 烷磺基、C₁-C₃ 鹵烷磺基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基、C₃-C₆ 環烷氧基、C₁-C₃ 烷磺基氧基、C₁-C₃ 鹵烷磺基氧基、C₂-C₄ 烷羧基、C₂-C₄ 烷羧基、C₁-C₃ 烷胺基、C₂-C₄ 二烷胺基、C₂-C₄ 烷羧胺基、-CH(=O)、-NHCH(=O)、-SF₅、-SC≡N 或 -U-V-T；

各 R^{3b} 獨立為氰基、C₁-C₃ 烷基、C₂-C₄ 烯基、C₂-C₄ 炔基、C₃-C₆ 環烷基、C₂-C₄ 烷氧烷基、C₂-C₄ 烷胺烷基、C₃-C₄ 二烷胺烷基、C₁-C₃ 烷氧基、C₂-C₄ 烷羧基或 C₂-C₄ 烷氧羧基；

R⁴ 為鹵素、-OR⁷ 或 -SC≡N；

R⁵ 為 H 或 C₁-C₄ 烷基；

R⁷ 為 H、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₂-C₆ 烯基、C₃-C₆ 炔基、C₃-C₆ 環烷基、C₂-C₆ 氰烷基、C₂-C₆ 烷氧烷基、-CH(=O)、-S(=O)₂OM¹ 或 -C(=W)R⁹；

R⁹ 為 C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烷氧烷基、C₂-C₆ 烷胺烷基、C₃-C₆ 二烷胺烷基、C₂-C₆ 烷硫烷基、C₁-C₆ 烷氧基或 C₁-C₆ 烷硫基；

各 U 獨立為 O、S(=O)_n、N(R¹⁰) 或一直接鍵；

各 V 獨立為 C₁-C₆ 伸烷基、C₂-C₆ 伸烯基、C₃-C₆ 伸炔基、C₃-C₆ 伸環烷基或 C₃-C₆ 伸環烯基，其中至多 3 個碳原子係獨立選自 C(=O)，各選擇性地經至多 5 個獨立選自鹵素、氰基、硝基、羥基、C₁-C₆ 烷

基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_1-C_6 烷氧基與 C_1-C_6 鹵烷氧基之取代基取代；

各 T 獨立為氰基、 $N(R^{11a})(R^{11b})$ 、 OR^{12} 或 $S(=O)_nR^{12}$ ；

各 R^{10} 獨立為 H 、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 烷羰基、 C_2-C_6 烷氧羰基、 C_2-C_6 (烷硫基)羰基、 C_2-C_6 烷氧基(硫羰基)、 C_4-C_8 環烷羰基、 C_4-C_8 環烷氧羰基、 C_4-C_8 (環烷硫基)羰基或 C_4-C_8 環烷氧基(硫羰基)；

各 R^{11a} 與 R^{11b} 獨立為 H 、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_3-C_6 鹵環烷基、 C_2-C_6 烷羰基、 C_2-C_6 烷氧羰基、 C_2-C_6 (烷硫基)羰基、 C_2-C_6 烷氧基(硫羰基)、 C_4-C_8 環烷羰基、 C_4-C_8 環烷氧羰基、 C_4-C_8 (環烷硫基)羰基或 C_4-C_8 環烷氧基(硫羰基)；或

一對 R^{11a} 與 R^{11b} 係與其所連接之氮原子一起形成一 3 至 6 員雜環，該環係選擇性地經至多 5 個獨立選自 R^{13} 之取代基取代；

各 R^{12} 獨立為 H 、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_3-C_6 鹵環烷基、 C_2-C_6 烷羰基、 C_2-C_6 烷氧羰基、 C_2-C_6 (烷硫基)羰基、 C_2-C_6 烷氧基(硫羰基)、 C_4-C_8 環烷羰基、 C_4-C_8 環烷氧羰基、 C_4-C_8 (環烷硫基)羰基或 C_4-C_8 環烷氧基(硫羰基)；

各 R^{13} 獨立為鹵素、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基或 C_1-C_6 烷氧基；

W 為 O 或 S ；

M^1 為 K、Na 或 Li；以及

各 n 獨立為 0、1 或 2；

其限制條件是當 Q^2 為一苯環且未經 R^{3a} 在鄰位取代，
則 Q^1 係經至少一個 R^{3a} 在一鄰位取代。

2. 如請求項 1 所述之化合物，其中：

Q^1 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；

Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；

或一吡唑環、咪唑環、吡啶環、嗒【口+井】環、
吡【口+井】環或嘧啶環，各環係選擇性地經至多
3 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環
員上之 R^{3b} 的取代基取代；

R^1 為 C_1 - C_2 烷基、 $-CH_2F$ 、 $-CH_2Cl$ 或環丙基；

R^2 為 H、鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_2 - C_4 烯基、鹵甲
基、氰甲基、羥甲基、 C_2 - C_3 烷氧烷基、 C_1 - C_2 烷
氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、
環丙基、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 烷硫基、 C_2 - C_3 烷羰
基或 -U-V-T；

各 R^{3b} 獨立為氰基、 C_1 - C_2 烷基、環丙基或 C_2 - C_3 烷氧
烷基；

R^4 為 Br、Cl、F、 $-OR^7$ 或 $-SC\equiv N$ ；

R^5 為 H 或甲基；

R^7 為 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_1 - C_3 鹵烷基、環丙
基、 C_2 - C_3 氰烷基、 C_2 - C_6 烷氧烷基、 $-S(=O)_2OM^1$
或 $-C(=W)R^9$ ；

R^9 為甲基或甲氧基；

各 U 獨立為 O 、 $N(R^{10})$ 或一直接鍵；

各 R^{10} 獨立為 H 或甲基；

各 V 獨立為 C_1-C_3 伸烷基，其中至多 1 個碳原子係選自 $C(=O)$ ；

各 T 獨立為 $N(R^{11a})(R^{11b})$ 或 OR^{12} ；

各 R^{11a} 與 R^{11b} 獨立為 H 或甲基；

各 R^{12} 獨立為 H 、 C_1-C_6 烷基或 C_1-C_6 鹵烷基；

W 為 O ；以及

M^1 為 Na 或 K 。

3. 如請求項 2 所述之化合物，其中：

Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；
或一吡啶環、咪啶環或吡啶環，各環係選擇性地
經 1 至 3 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮
原子環員上之 R^{3b} 的取代基取代；

R^1 為甲基、 $-CH_2F$ 或 $-CH_2Cl$ ；

R^2 為鹵素、氰基、 C_1-C_2 烷基、鹵甲基、氰甲基、羥甲
基、 C_1-C_2 烷氧基或 C_1-C_2 鹵烷氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、甲基、鹵甲基、環丙基、甲
氧基、甲硫基、甲羰基或 $-U-V-T$ ；

各 R^{3b} 為甲基；

R^4 為 Br 、 Cl 、 F 或 $-OR^7$ ；

R^7 為 H 、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 $-S(=O)_2OM^1$ 或
 $-C(=W)R^9$ ；

各 U 獨立為 O 、 NH 或一直接鍵；

各 V 為 C₁-C₃ 伸烷基；以及

各 R¹² 獨立為 H、甲基或鹵甲基。

4. 如請求項 3 所述之化合物，其中：

Q² 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；

R¹ 為甲基；

R² 為鹵素、氰基、甲基、鹵甲基或甲氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、甲基、鹵甲基或甲氧基；

R⁴ 為 -OR⁷；

R⁵ 為 H；

R⁷ 為 H、甲基或 -C(=W)R⁹；以及

R⁹ 為甲基。

5. 如請求項 4 所述之化合物，其中：

R² 為 Br、Cl、甲基或甲氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基或甲氧基；以及

R⁷ 為 H。

6. 如請求項 5 所述之化合物，其中：

R² 為甲基；

各 R^{3a} 獨立為 Br、Cl、F、氰基或甲氧基；以及

Q¹ 與 Q² 其中一者係經 2 至 3 個取代基取代並且 Q¹ 與 Q² 中之另一者係經 1 至 2 個取代基取代。

7. 如請求項 1 所述之化合物，其係選自以下群組：

α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

(αS)- α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

(αR)- α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2-氯-6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2,6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

(αS)- α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

(αR)- α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2,6-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

α ,5-雙(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2-溴苯基)- α -(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2,6-二氯苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

α -(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-5-(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-4-甲醇；

α -(2-溴-4-氟苯基)-5-(2,6-二氯苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

α -(2-溴-4-氟苯基)-5-(2-氯-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

3-溴-5-(2-氯-4-氟苯基)- α -(2,4-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2-氯-4-氟苯基)- α -(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2,4-二氯苯基)- α -(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2-氯-6-氟苯基)- α -(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

α -(2,4-二氟苯基)-5-(2,6-二氯苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

4-[4-[(2,4-二氟苯基)羧甲基]-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]-3,5-二氟苯甲腈；

5-(2-氯-6-氟苯基)- α -(2,4-二氯苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2-氯-6-氟苯基)- α -(2,6-二氯苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基- α -(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2-溴-4-氟苯基)-1,3-二甲基- α -(2,4,6-三氟苯基)-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2-氯-6-氟苯基)- α -(2-氯-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

3-溴- α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

3-氯- α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

α -(2-氯-4-氟苯基)-5-(2-氯-6-氟苯基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2,6-二氟苯基)- α -(4-氟-2-甲基苯基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

α -(2-氯-4-甲氧基苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2,6-二氟苯基)-3-甲氧基- α -(4-甲氧基-2-甲基苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

5-(2-氯-6-氟苯基)- α -(2-氯-4-甲氧基苯基)-3-甲氧基-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

3-氯-5-(2,6-二氟苯基)- α -(4-甲氧基-2-甲基苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

3-氯-5-(2,6-二氟苯基)- α -(2-氯-4-甲氧基苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；

3-氯- α -(2-氯-4-甲氧基苯基)-5-(2,6-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇；以及

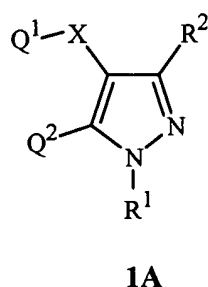
3-溴-5-(2,6-二氟苯基)- α -(4-甲氧基-2-甲基苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醇。

8. 一種殺真菌組成物，其包含(a)請求項 1 所述之化合物；及
(b)至少一種其他殺真菌劑。

9. 一種殺真菌組成物，其包含(a)請求項 1 所述之化合物；及
(b)至少一種選自於由界面活性劑、固體稀釋劑與液體稀釋劑所組成之群組的額外組分。

10. 一種用於防治由真菌類植物病原體造成之植物病害的方法，其包含施予該植物或其部分或該植物種子一殺真菌有效量之一請求項 1 所述之化合物。

11. 一種選自式 1A、其 *N*-氧化物及其鹽類之化合物，



其中

Q^1 為一經 1 至 5 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；
 Q^2 為一經 1 至 5 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；或一 5 至 6 員完全不飽和之雜環，各環含有選自碳原子與 1 至 3 個雜原子之環員，該雜原子係獨立選自至多 2 個 O、至多 2 個 S 與至多 3 個 N 原子，其中至多 2 個碳環員係獨立選自 C(=O) 與 C(=S)，各環係選擇性地經至多 5 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} 的取代基取代；

X 為 O、S(O)_m、N(R⁶) 或 C(=O)；

R^1 為 C₁-C₂ 烷基、鹵甲基、氰甲基或環丙基；

R^2 為 H、鹵素、氰基、C₁-C₂ 烷基、C₂-C₄ 烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₂-C₃ 氰烷基、C₁-C₂ 羥烷基、

環丙基、鹵環丙基、 C_2-C_3 烷氧烷基、 C_1-C_2 烷硫基、 C_1-C_2 烷氧基或 C_1-C_2 鹵烷氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、羥基、硝基、胺基、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_3-C_6 環烷基、 C_3-C_6 鹵環烷基、 C_4-C_6 烷環烷基、 C_4-C_6 環烷烷基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 鹵烷硫基、 C_1-C_3 烷亞磺基、 C_1-C_3 鹵烷亞磺基、 C_1-C_3 烷磺基、 C_1-C_3 鹵烷磺基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_3-C_6 環烷氧基、 C_1-C_3 烷磺基氧基、 C_1-C_3 鹵烷磺基氧基、 C_2-C_4 烷羧基、 C_2-C_4 烷羧基、 C_1-C_3 烷胺基、 C_2-C_4 二烷胺基、 C_2-C_4 烷羧胺基、 $-CH(=O)$ 、 $-NHCH(=O)$ 、 $-SF_5$ 、 $-SC\equiv N$ 或 $-U-V-T$ ；

各 R^{3b} 獨立為氰基、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_2-C_4 烷氧烷基、 C_2-C_4 烷胺烷基、 C_3-C_4 二烷胺烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_2-C_4 烷羧基或 C_2-C_4 烷氧羧基；

R^6 為 H 、羥基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_2-C_6 烷氧烷基、 C_2-C_6 氰烷基、 NH_2 、 $-CH(=O)$ 、 $-OR^7$ 、 $-OS(=O)_2M^1$ 、 $-S(=O)_nR^8$ 或 $-C(=W)R^9$ ；

R^7 為 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_2-C_6 氰烷基、 C_2-C_6 烷氧烷基、 $-CH(=O)$ 、 $-S(=O)_2OM^1$ 或 $-C(=W)R^9$ ；

R^8 為 C_1-C_6 烷基或 C_1-C_6 鹵烷基；

R^9 為 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烷氧烷基、 C_2 - C_6 烷胺烷基、 C_3 - C_6 二烷胺烷基、 C_2 - C_6 烷硫烷基、 C_1 - C_6 烷氧基或 C_1 - C_6 烷硫基；

各 U 獨立為 O 、 $S(=O)_n$ 、 $N(R^{10})$ 或一直接鍵；

各 V 獨立為 C_1 - C_6 伸烷基、 C_2 - C_6 伸烯基、 C_3 - C_6 伸炔基、 C_3 - C_6 伸環烷基或 C_3 - C_6 伸環烯基，其中至多 3 個碳原子係獨立選自 $C(=O)$ ，各選擇性地經至多 5 個獨立選自鹵素、氰基、硝基、羥基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_1 - C_6 烷氧基與 C_1 - C_6 鹵烷氧基之取代基取代；

各 T 獨立為氰基、 $N(R^{11a})(R^{11b})$ 、 OR^{12} 或 $S(=O)_nR^{12}$ ；

各 R^{10} 獨立為 H 、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 烷羰基、 C_2 - C_6 烷氧羰基、 C_2 - C_6 (烷硫基)羰基、 C_2 - C_6 烷氧基(硫羰基)、 C_4 - C_8 環烷羰基、 C_4 - C_8 環烷氧羰基、 C_4 - C_8 (環烷硫基)羰基或 C_4 - C_8 環烷氧基(硫羰基)；

各 R^{11a} 與 R^{11b} 獨立為 H 、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_3 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、 C_2 - C_6 烷羰基、 C_2 - C_6 烷氧羰基、 C_2 - C_6 (烷硫基)羰基、 C_2 - C_6 烷氧基(硫羰基)、 C_4 - C_8 環烷羰基、 C_4 - C_8 環烷氧羰基、 C_4 - C_8 (環烷硫基)羰基或 C_4 - C_8 環烷氧基(硫羰基)；或

一對 R^{11a} 與 R^{11b} 係與其所連接之氮原子一起形成一 3 至 6 員雜環，該環係選擇性地經至多 5 個獨立選自 R^{13} 之取代基取代；

各 R^{12} 獨立為 H、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_3-C_6 鹵環烷基、 C_2-C_6 烷羰基、 C_2-C_6 烷氧羰基、 C_2-C_6 (烷硫基)羰基、 C_2-C_6 烷氧基(硫羰基)、 C_4-C_8 環烷羰基、 C_4-C_8 環烷氧羰基、 C_4-C_8 (環烷硫基)羰基或 C_4-C_8 環烷氧基(硫羰基)；

各 R^{13} 獨立為鹵素、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基或 C_1-C_6 烷氧基；

W 為 O 或 S；

M^1 為 K、Na 或 Li；

m 為 0、1 或 2；及

各 n 獨立為 0、1 或 2；

其限制條件為：

(a) 當 Q^2 為一苯環且未經 R^{3a} 在鄰位取代，則 Q^1 係經至少一個 R^{3a} 在一鄰位取代；並且

(b) 該化合物非為 1-[2-[4-(2,4-二氯苯甲醯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-5-基]苯基]乙酮。

12. 如請求項 11 所述之化合物，其中

Q^1 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；

Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；或一吡唑環、咪唑環、吡啶環、嗒【口+井】環、吡【口+井】環或嘧啶環，各環係選擇性地經至多 3 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} 的取代基取代；

X 為 O、S、N(R^6)或 C(=O)；

R^1 為 C_1 - C_2 烷基、 $-CH_2F$ 、 $-CH_2Cl$ 或環丙基；

R^2 為 H、鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_2 - C_4 烯基、鹵甲基、氰甲基、羥甲基、 C_2 - C_3 烷氧烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、環丙基、 C_1 - C_2 烷氧基、 C_1 - C_2 烷硫基、 C_2 - C_3 烷羰基或 $-U-V-T$ ；

各 R^{3b} 獨立為氰基、 C_1 - C_2 烷基、環丙基或 C_2 - C_3 烷氧烷基；

R^6 為 H、羥基、 $-CH(=O)$ 、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_2 - C_3 烷氧烷基、 $-OR^7$ 、 $-S(=O)_2OM^1$ 、 $-S(=O)_nR^8$ 或 $-C(=W)R^9$ ；

R^7 為 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_1 - C_3 鹵烷基、環丙基、 C_2 - C_3 氰烷基、 C_2 - C_6 烷氧烷基、 $-S(=O)_2OM^1$ 或 $-C(=W)R^9$ ；

R^8 為甲基；

R^9 為甲基或甲氧基；

各 U 獨立為 O、 $N(R^{10})$ 或一直接鍵；

各 R^{10} 獨立為 H 或甲基；

各 V 獨立為 C_1 - C_3 伸烷基，其中至多 1 個碳原子係選自 $C(=O)$ ；

各 T 獨立為 $N(R^{11a})(R^{11b})$ 或 OR^{12} ；

各 R^{11a} 與 R^{11b} 獨立為 H 或甲基；

各 R^{12} 獨立為 H、 C_1 - C_6 烷基或 C_1 - C_6 鹵烷基；

W 為 O；以及

M^1 為 Na 或 K。

13. 如請求項 12 所述之化合物，其中：

Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；或一吡啶環、咪唑環或吡啶環，各環係選擇性地經 1 至 3 個獨立選自在碳原子環員上之 R^{3a} 與在氮原子環員上之 R^{3b} 的取代基取代；

R^1 為甲基、 $-CH_2F$ 或 $-CH_2Cl$ ；

R^2 為鹵素、氰基、 C_1-C_2 烷基、鹵甲基、氰甲基、羥甲基、 C_1-C_2 烷氧基或 C_1-C_2 鹵烷氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、甲基、鹵甲基、環丙基、甲氧基、甲硫基、甲羰基或 $-U-V-T$ ；

各 R^{3b} 為甲基；

R^6 為 H、甲基、鹵甲基或 $-OR^7$ ；

R^7 為 H、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 $-S(=O)_2OM^1$ 或 $-C(=W)R^9$ ；

各 U 獨立為 O、NH 或一直接鍵；

各 V 為 C_1-C_3 伸烷基；與

各 R^{12} 獨立為 H、甲基或鹵甲基。

14. 如請求項 13 所述之化合物，其中：

Q^2 為一經 1 至 3 個獨立選自 R^{3a} 之取代基取代的苯環；

R^1 為甲基；

R^2 為鹵素、氰基、甲基、鹵甲基或甲氧基；

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基、甲基、鹵甲基或甲氧基；

R^7 為 H、甲基或 $-C(=W)R^9$ ；以及

R^9 為甲基。

15. 如請求項 14 所述之化合物，其中：

X 為 O、S、NH 或 C(=O)；

R² 為 Br、Cl、甲基或甲氧基；以及

各 R^{3a} 獨立為鹵素、氰基或甲氧基。

16. 如請求項 15 所述之化合物，其中：

R² 為甲基；

各 R^{3a} 獨立為 Br、Cl、F、氰基或甲氧基；以及

Q¹ 與 Q² 其中一者係經 2 至 3 個取代基取代並且 Q¹ 與 Q² 中之另一者係經 1 至 2 個取代基取代。

17. 如請求項 11 所述之化合物，其係選自以下群組：

5-(2-氯-4-甲氧苯基)-4-(2,4-二氯苯氧基)-1,3-二甲基-1H-吡唑；

4-(2-氯-4-氟苯氧基)-5-(2-氯-4-甲氧苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑；

3-氯-4-[4-(2-氯-4-氟苯氧基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-5-基]苯甲腈；

4-[[5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-基]胺基]-3,5-二氯苯甲腈；

N,5-雙(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-胺；

3-氯-4-[[5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-基]氧基]苯甲腈；

5-(2-氯-4-氟苯基)-N-(2,4-二氯苯基)-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-胺；

5-(2-氯-4-氟苯基)-*N*-(4-氯-2-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-胺；

4-(2-氯-4-氟苯甲酰基)-5-(2,4-二氟苯基)-1-甲基-1*H*-吡唑-3-腈；

N-(2-溴-4-氟苯基)-5-(2-氯-4-氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-胺；

N-(2,4-二氯苯基)-5-(2,4-二氟苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-胺；以及

[5-(2,4-二氯苯基)-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-基](2,4-二氟苯基)甲酮。

18. 一種殺真菌組成物，其包含(a)請求項 11 所述之化合物；及(b)至少一種其他殺真菌劑。

19. 一種殺真菌組成物，其包含(a)請求項 11 所述之化合物；及(b)至少一種選自由界面活性劑、固體稀釋劑與液體稀釋劑所組成之群組的額外組分。

20. 一種用於防治由真菌類植物病原體造成之植物病害的方法，其包含施予該植物或其部分或該植物種子一殺真菌有效量之一請求項 11 所述之化合物。

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第（無）圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

