



(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 201022212 A1

(43)公開日：中華民國 99 (2010) 年 06 月 16 日

(21)申請案號：098129482

(22)申請日：中華民國 98 (2009) 年 09 月 02 日

(51)Int. Cl.：

C07D239/48 (2006.01)

C07D417/12 (2006.01)

A01N43/54 (2006.01)

A01N43/78 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

(30)優先權：2008/09/03 歐洲專利局 08163610.2

(71)申請人：拜耳作物科學股份有限公司 (德國) BAYER CROPSCIENCE

AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

德國

(72)發明人：格瑞爾 喬格 GREUL, JOERG NICO (DE)；格特森 奧利弗 GAERTZEN, OLIVER

(DE)；哈姆克 韓德克 HELMKE, HENDRIK (DE)；喜爾布蘭登 史代芬

HILLEBRAND, STEFAN (DE)；馬堤斯 阿摩斯 MATTES, AMOS (DE)；瓦奈爾

皮爾 WASNAIRE, PIERRE (DE)；尼星 卡爾 NISING, CARL FRIEDRICH

(DE)；瓦奈門 尤瑞克 WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE (DE)；達門 彼

得 DAHMEN, PETER (DE)；維爾斯堤 恩德 VOERSTE, ARND (DE)；梅斯爾

露絲 MEISSNER, RUTH (DE)；布朗 克里斯多夫 BRAUN, CHRISTOPH

ANDREAS (DE)；考斯門 馬汀 KAUSSMANN, MARTIN (DE)；波多野廣幸

HADANO, HIROYUKI (JP)；柯利佳 馬歇爾 CALLEJA, MARCEL (FR)

(74)代理人：林秋琴；何愛文

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：13 項 圖式數：0 共 196 頁

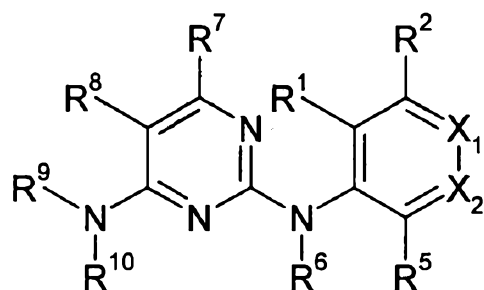
(54)名稱

4-烷基-取代之二胺基嘓啶類

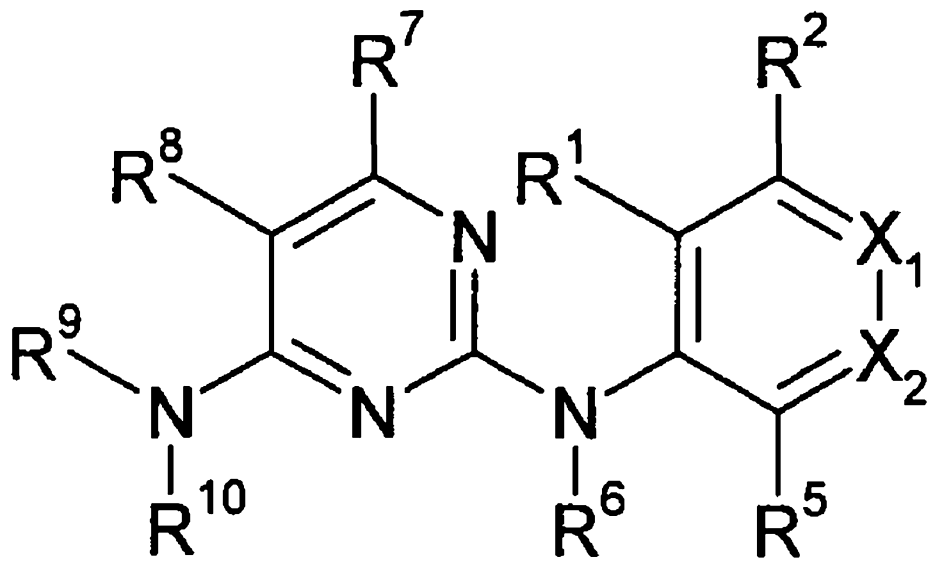
4-ALKYL-SUBSTITUTED DIAMINOPYRIMIDINES

(57)摘要

本發明係關於式(I)之 4-烷基-取代之二胺基嘓啶類作為殺真菌劑之用途，



其中 R¹ 至 R¹³ 及 X¹ 與 X² 具有發明說明中提供的意義，及其農藝化學活性鹽類，在植物內部及/或上面或植物種子內部及/或上面用於控制植物病源有害的真菌之方法及組成物，製備此組成物及處理種子之方法以及其在農業、園藝及森林、在物質保護及在家庭與衛生領域中用於控制植物病源有害的真菌之用途。本發明還關於式(Ia)、(Ib)及(Ic)之二胺基嘓啶類之製備方法。





(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 201022212 A1

(43)公開日：中華民國 99 (2010) 年 06 月 16 日

(21)申請案號：098129482

(22)申請日：中華民國 98 (2009) 年 09 月 02 日

(51)Int. Cl.：

C07D239/48 (2006.01)

C07D417/12 (2006.01)

A01N43/54 (2006.01)

A01N43/78 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

(30)優先權：2008/09/03 歐洲專利局 08163610.2

(71)申請人：拜耳作物科學股份有限公司 (德國) BAYER CROPSCIENCE

AKTIENGESELLSCHAFT (DE)

德國

(72)發明人：格瑞爾 喬格 GREUL, JOERG NICO (DE)；格特森 奧利弗 GAERTZEN, OLIVER

(DE)；哈姆克 韓德克 HELMKE, HENDRIK (DE)；喜爾布蘭登 史代芬

HILLEBRAND, STEFAN (DE)；馬堤斯 阿摩斯 MATTES, AMOS (DE)；瓦奈爾

皮爾 WASNAIRE, PIERRE (DE)；尼星 卡爾 NISING, CARL FRIEDRICH

(DE)；瓦奈門 尤瑞克 WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE (DE)；達門 彼

得 DAHMEN, PETER (DE)；維爾斯堤 恩德 VOERSTE, ARND (DE)；梅斯爾

露絲 MEISSNER, RUTH (DE)；布朗 克里斯多夫 BRAUN, CHRISTOPH

ANDREAS (DE)；考斯門 馬汀 KAUSSMANN, MARTIN (DE)；波多野廣幸

HADANO, HIROYUKI (JP)；柯利佳 馬歇爾 CALLEJA, MARCEL (FR)

(74)代理人：林秋琴；何愛文

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：13 項 圖式數：0 共 196 頁

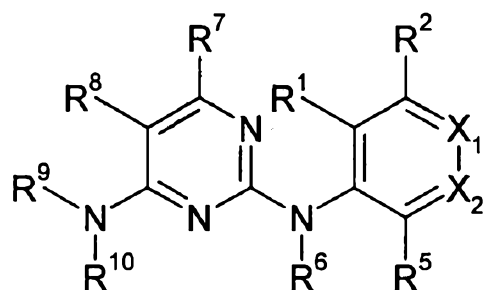
(54)名稱

4-烷基-取代之二胺基嘓啶類

4-ALKYL-SUBSTITUTED DIAMINOPYRIMIDINES

(57)摘要

本發明係關於式(I)之 4-烷基-取代之二胺基嘓啶類作為殺真菌劑之用途，



其中 R¹ 至 R¹³ 及 X¹ 與 X² 具有發明說明中提供的意義，及其農藝化學活性鹽類，在植物內部及/或上面或植物種子內部及/或上面用於控制植物病源有害的真菌之方法及組成物，製備此組成物及處理種子之方法以及其在農業、園藝及森林、在物質保護及在家庭與衛生領域中用於控制植物病源有害的真菌之用途。本發明還關於式(Ia)、(Ib)及(Ic)之二胺基嘓啶類之製備方法。

六、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明係關於4-烷基-取代之二胺基嘧啶類及其農藝化學活性鹽類，及其在植物內部及/或上面或植物種子內部及/或上面用於控制植物病源有害的真菌之用途與方法及組成物，製備此組成物及處理種子之方法以及其在農業、園藝及森林、在物質保護及在家庭與衛生領域中用於控制植物病源有害的真菌之用途。本發明還關於4-烷基-取代之二胺基嘧啶類之製備方法。

【先前技術】

已知某些炔基-取代之二胺基嘧啶類可以作為殺真菌的農作物保護劑使用(見 DE 4029650 A1)。但是，特別是在低使用率下，這些化合物之殺真菌活性並非都足夠。

由於對現代殺菌劑在生態和經濟上的要求不斷增加，例如在活性範圍、毒性、選擇性、使用率、殘留物的形成及有利的生產，以及可能有另外的問題例如抗藥性，持續需要研發新穎的農作物保護劑，特別是殺真菌劑，其至少在部份方面具有超越已知的農作物保護劑之優點。

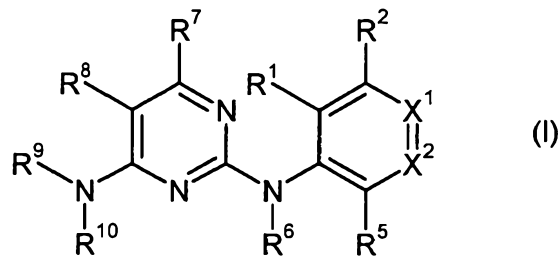
訝異地，現經發現本發明4-烷基-取代之二胺基嘧啶類至少解決所提到的部份主題且合適作為農作物保護劑使用，特別是作為殺真菌劑。

部份這些4-烷基-取代之二胺基嘧啶類已知是醫藥活性化合物(見例如 WO 07/003596、WO 06/087230、WO 05/111022、WO 05/111023、WO 05/037800、WO 04/065378、

WO 04/056786、WO 04/056807、WO 04/048343、WO 03/032997、WO 03/030909、WO 02/096888), 但不是其驚人的殺真菌活性。

【發明內容】

本發明提供式(I)化合物作為殺真菌劑之用途



其中符號定義如下：

X^1 代表氮或 CR^3 ,

X^2 代表氮或 CR^4 ,

其中 X^1 及 X^2 不都代表氮,

R^1 及 R^5 彼此獨立地代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基或鹵基,

R^2 代表氫、鹵基、硝基、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_2 -鹵烷基、羥基、 OR^{12} 、 $OCON(R^{12})_2$ 、 COR^{12} 、 $CR^{12}=NOR^{12}$ 、 SF_5 、 SR^{12} 、 SOR^{12} 、 SO_2R^{12} 、 CO_2R^{12} 、 $N(R^{12})_2$ 、 $NR^{12}COR^{12}$ 或 $NR^{12}CO_2R^{13}$,

R^3 及 R^4 彼此獨立地代表氫、鹵基、硝基、氰基、3-至 8-員未經取代或經取代的飽和或不飽和的單環其不含或含有至多四個選自包括 N、O 及 S 的雜原子，其中兩個氧原子不相鄰、 OR^{12} 、 $OCON(R^{12})_2$ 、 $OCOR^{13}$ 、 SF_5 、 SR^{12} 、 SOR^{12} 、 SO_2R^{12} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、 $C=OR^{12}$ 、 $CO(CH_2)_mCN$ 、 $CR^{12}=NOR^{12}$ 、 $CON(R^{12})_2$ 、 $COOR^{12}$ 、 $NR^{12}COR^{12}$ 、 $NR^{12}CSR^{13}$ 、 $NR^{12}COOR^{13}$ 、

$\text{NR}^{12}(\text{C}=\text{S})\text{OR}^{13}$ 、 $\text{N}(\text{R}^{12})_2$ 、 $\text{NR}^{12}\text{SO}_2\text{R}^{13}$ 、 $[\text{C}(\text{R}^{12})_2]_m\text{CN}$ 、
 $(\text{CH}_2)_m\text{SON}(\text{R}^{12})_2$ 、 $(\text{CH}_2)_m\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{12})_2$ 、 $(\text{CR}^{12})_m\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{12})_2$ 、
 $(\text{CH}_2)_m\text{COOR}^{12}$ 、 $(\text{CH}_2)_m\text{COR}^{12}$ 、 $[\text{C}(\text{R}^{12})_2]_m\text{COR}^{12}$ 、
 $(\text{CH}_2)_m\text{CON}(\text{R}^{12})_2$ 、 $[\text{C}(\text{R}^{12})_2]_m\text{CON}(\text{R}^{12})_2$ 、 $(\text{CH}_2)_m\text{NR}^{12}\text{COR}^{12}$ 、
 $(\text{CH}_2)_m\text{NR}^{12}_2$ 、 $(\text{CH}_2)_m\text{NR}^{12}\text{COOR}^{13}$ 、 $[\text{C}(\text{R}^{12})_2]_m\text{NR}^{12}\text{COR}^{12}$ 、
 $[\text{C}(\text{R}^{12})_2]_m\text{NR}^{12}\text{COOR}^{13}$ 、未經取代或經取代的 C_1 - C_8 -烷基、
 C_2 - C_6 -烯基、 C_1 - C_8 -鹵烷基；其中 $m=1-4$ ，

其中另外 R^3 及 R^4 ，如果適當時經由 R^{12} 及 R^{13} 一起可形成
 5-至 7-員未經取代或經取代的飽和或不飽和的單環其不含
 或含有至多四個選自包括 N、O 及 S 的雜原子，其中兩個
 氧原子不相鄰，

其中取代基是彼此獨立地選自包括氫、氟、氯及溴、 C_1 - C_4 -
 烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、羥基、酮基、 C_1 - C_4 -鹵烷基、(C_1 - C_4 -
 烷基)羰基或氰基，

R^6 代表氫、 C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_4)$ 烷基、甲醯
 基、(C_1 - C_4 -烷基)羰基、(C_1 - C_4 -烷氧基- C_1 - C_4 -烷基)羰基、
 (C_3 - C_6 -烯氧基)羰基、(C_3 - C_6 -環烷基)羰基、(鹵基- C_1 - C_4 -烷
 氧基- C_1 - C_4 -烷基)羰基、(C_1 - C_4 -鹵基烷基)羰基、(C_1 - C_4 -烷氧
 基)羰基、(C_1 - C_4 -鹵基烷氧基)羰基、苄氧基羰基、未經取代
 或經取代的苄基、未經取代或經取代的苯甲醯基、未經取
 代或經取代的 C_2 - C_6 -烯基、未經取代或經取代的 C_2 - C_6 -炔
 基、 C_1 - C_2 -烷基亞磺醯基或 C_1 - C_2 -烷基磺醯基，

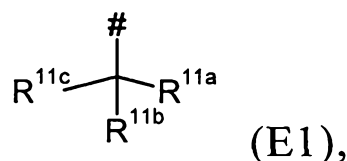
其中取代基是彼此獨立地選自包括氫、氟、氯及溴、 C_1 - C_4 -
 烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基、羥基、 C_1 - C_4 -鹵基烷基及氰基，

R^7 代表氫、 C_1 - C_3 -烷基、氰基或 C_1 - C_3 -鹵基烷基，

R^8 代表氯、溴、碘、氰基、甲基、SMe、SOMe、SO₂Me、CF₃、CCl₃、CFH₂ 或 CF₂H，

R^9 代表氫、 C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基- $(C_1$ - $C_4)$ 烷基、 $(C_1$ - C_4 -烷基)羰基、 $(C_1$ - C_4 -鹵基烷基)羰基、 $(C_1$ - C_4 -烷氧基)羰基 或 隨意地經氟-、氯-、溴-、氰基-或 CF₃-取代之 C_2 - C_4 -烯基，

R^{10} 代表下式之 E1 基



其中符號定義如下且 # 代表連接至氮原子的點：

R^{11a} 代表氫或甲基，

R^{11b} 代表氫或 C_1 - C_3 -烷基，

R^{11c} 代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、CN、CH₂CN、CH(Me)CN、

C(Me)₂CN、CH₂OH、CH₂O- $(C_1$ - C_3 -烷基)、CH₂O- $(C_1$ - C_3 -鹵基烷基)、C(Me)HOH、C(Me)₂OH、C(Me)HO- $(C_1$ - C_3 -烷基)、

C(Me)₂O- $(C_1$ - C_3 -烷基)、C(Me)HO- $(C_1$ - C_3 -鹵基烷基)、

C(Me)₂O- $(C_1$ - C_3 -鹵基烷基)、CH₂S- $(C_1$ - C_3 -烷基)、

C(Me)HS- $(C_1$ - C_3 -烷基)、C(Me)₂S- $(C_1$ - C_3 -烷基)、Si(C_1 - C_2 -烷基)₃ 或 C_2 - C_4 -烯基其係隨意地經鹵基或 CF₃ 取代；

或

R^{10} 代表環戊基或環己基環其可隨意地經 CN、鹵基、 C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_3 -烷氧基、 C_1 - C_3 -鹵基烷基、 C_1 - C_3 -鹵基烷氧基 或 C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基單-或多取代；

R^{12} 是相同或不同且是氫、 C_1 - C_6 -烷基、 C_1 - C_6 -鹵基烷基、未經取代或經取代的 C_3 - C_6 -環烷基、 C_1 - C_4 -三烷基矽烷基、未經取代或經取代的 C_2 - C_4 -烯基、未經取代或經取代的 C_2 - C_4 -炔基、未經取代或經取代的苯基、 C_1 - C_4 -烷氧基(C_1 - C_4)烷基、未經取代或經取代的苄基或 3-至 7-員未經取代或經取代的飽和或不飽和的環其不含或含有至多四個選自包括 N、O 及 S 的雜原子，其中兩個氧原子不相鄰，

或

如果兩個 R^{12} 基團是連接至一個氮原子，兩個 R^{12} 基團可以形成 3-至 7-員未經取代或經取代的飽和或不飽和的環其不含或含有至多四個選自包括 N、O 及 S 的雜原子，其中兩個氧原子不相鄰，

或

如果兩個 R^{12} 基團是在 $NR^{12}COR^{12}$ 、 $NR^{12}SOR^{12}$ 、 $NR^{12}SO_2R^{12}$ 、 $NR^{12}SONR^{12}$ 、 $NR^{12}SO_2NR^{12}$ 基團中相鄰，兩個 R^{12} 基團可以形成 3-至 7-員未經取代或經取代的飽和或不飽和的環其不含或含有至多四個選自包括 N、O 及 S 的雜原子，其中兩個氧原子不相鄰，

R^{13} 是相同或不同且是 C_1 - C_8 -烷基、 C_1 - C_8 -鹵基烷基、 C_1 - C_4 -三烷基矽烷基、未經取代或經取代的 C_2 - C_6 -烯基、未經取代或經取代的 C_2 - C_6 -炔基、未經取代或經取代的 C_3 - C_6 -環烷基、未經取代或經取代的芳基、 C_1 - C_4 -烷氧基-(C_1 - C_4)烷基、未經取代或經取代的苄基或 3-至 7-員未經取代或經取代的飽和或不飽和的環其不含或含有至多四個選自包括 N、

O 及 S 的雜原子，其中兩個氧原子不相鄰，
 其中兩個 R¹³ 可形成 3-至 7-員未經取代或經取代的飽和或不飽和的環其不含或含有至多四個選自包括 N、O 及 S 的雜原子，其中兩個氧原子不相鄰，
 且其中可能的取代基是選自包括下面的名單：
 氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、CF₃、CFH₂、CF₂H、C₂F₅、CCl₃、羥基、OMe、OEt、OPr、OisoPr、OBu、OsecBu、OisoBu、OtertBu、O(CH₂)₂OCH₃、O(CH₂)₃OCH₃、O-環戊基、O-苯基、OCF₃、OCF₂H、OCF₂CF₃、OCF₂CF₂H、SH、SMe、SEt、SCF₃、SCF₂H、SPh、SCF₅、SO₂Me、SO₂CF₃、SOMe、SOEt、CO₂H、CO₂CH₃、CO₂Et、CO₂Pr、CO₂isoPr、CO₂tertBu、COMe、COCF₃、NH₂、NHMe、NMe₂、NH₂Et、NEt₂、NHPr、NHisoPr、NHnBu、NHtertBu、NHisoBu、NHsecBu、環丙胺基、甲醯基、CH₂CN、CHMeCN、CH₂COCH₃、CH₂OMe、(CH₂)₂OMe、(CH₂)₃OMe、CH₂OH、CH₂SMe、(CH₂)₂SMe、甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、環丙基、1-甲氧基環丙基、1-氯環丙基、環丁基、3-二甲基丁基、環戊基、環己基、環己基甲基、新戊基、丙-2-烯-1-基、1-甲基丙-2-烯-1-基、丁-3-烯-1-基、(三甲基矽烷基)甲基、苯基、苄基、-CH₂CH=CH₂、-CH(CH₃)CH=CH₂、-CH₂C≡CH，
 及其農藝化學活性鹽類。

根據本發明之式(I)之二胺基嘧啶類及其農藝化學活性鹽類非常合適作為殺蟲劑使用，且特別是用於控制植物病

源有害的真菌。根據本發明上述之化合物具有特別強的殺真菌活性且可以同時用在農作物保護、家庭及衛生領域以及物質之保護。

式(I)之化合物可以同時存在為純的形式或作為多種可能的異構物形式之混合物，特別是立體異構物，例如 E 及 Z、蘇-及赤-、以及光學異構物，例如 R 及 S 異構物，或阻轉異構物，及如果適當時的互變異構物。申請專利的是 E 及 Z 異構物、蘇-及赤-、及光學異構物、這些異構物之任何混合物，以及可能的互變異構物形式。

較宜使用其中一或多個符號是定義如下的式(I)化合物作為殺真菌劑：

X^1 代表氮或 CR^3 ，

X^2 代表氮或 CR^4 ，

其中 X^1 及 X^2 不都代表氮，

R^1 及 R^5 彼此獨立地代表氫、 C_1 - C_2 -烷基、 C_1 - C_2 -烷氧基、F、Cl 或 Br，

R^2 代表氫、鹵基、硝基、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_2 -鹵烷基、羥基、 C_1 - C_4 -烷氧基、O- $(C_2$ - C_4 -烯基)、O- $(C_2$ - C_4 -炔基)、OCONH- $(C_1$ - C_4 -烷基)、OCON- $(C_1$ - C_4 -烷基) $_2$ 、 C_1 - C_3 -鹵烷氧基、COH、CO- $(C_1$ - C_4 -烷基)、C(=NOH)Me、C(=NO)- $(C_1$ - C_4 -烷基)Me、CH(=NO)- $(C_1$ - C_4 -烷基)、SF $_5$ 、S- $(C_1$ - C_3)-烷基、S- $(C_1$ - C_2)-鹵烷基、SO- $(C_1$ - C_4 -烷基)、SO $_2$ - $(C_1$ - C_4 -烷基)、CO $_2$ - $(C_1$ - C_3 -烷基)、NH $_2$ 、NH- $(C_1$ - C_4 -烷基)、N- $(C_1$ - C_4 -烷基) $_2$ 、NHCO- $(C_1$ - C_4 -烷基)、NHCOH、NMeCO- $(C_1$ - C_4 -烷基)或

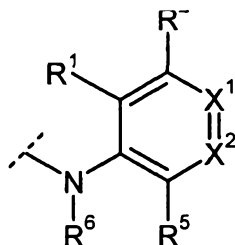
$\text{NHCO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$,

R^3 及 R^4 彼此獨立地代表氫、鹵基、氰基、硝基、羥基、
 $\text{O-(C}_1\text{-C}_4\text{)-烷基}$ 、 $\text{O-(C}_3\text{-C}_6\text{-環烷基)}$ 、 $\text{O-(C}_1\text{-C}_4\text{-鹵烷基)}$ 、
 $\text{OCONH-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 $\text{OCON-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}_2$ 、 $\text{OCO-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、
 SH 、 SF_5 、 $\text{S-(C}_1\text{-C}_3\text{-烷基)}$ 、 $\text{S-(C}_1\text{-C}_3\text{-鹵烷基)}$ 、 SPh 、
 $\text{SO-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 $\text{SO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 $\text{SO}_2\text{-(C}_2\text{-C}_4\text{-烯基)}$ 、
 $\text{SO}_2\text{-(C}_2\text{-C}_4\text{-炔基)}$ 、 $\text{SO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_2\text{-鹵烷基)}$ 、 $\text{SO}_2\text{N-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、
 $\text{CO-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 $\text{(C}_1\text{-C}_3\text{-鹵烷基)羰基}$ 、
 COCH_2CN 、 $\text{CONH-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 $\text{CON-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}_2$ 、
 $\text{CONH-(C}_1\text{-C}_3\text{-鹵烷基)}$ 、 $\text{CONH-(C}_2\text{-C}_4\text{-烯基)}$ 、 $\text{CONH-(C}_2\text{-C}_4\text{-炔基)}$ 、
 $\text{CONH-(C}_3\text{-C}_6\text{-環烷基)}$ 、 $\text{CONHCH(CH}_3\text{)CH}_2\text{OCH}_3$ 、
 $\text{CONH(CH}_2\text{)}_m\text{O-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 CONHPh 、六氫吡啶-1-基羰基、
嗎福啉-4-基羰基、(4-甲基六氫吡啶-1-基)羰基、吡咯啉-1-基羰基、
吡丁啉-1-基羰基、氮丙啉-1-基羰基、六甲基亞胺-1-基羰基、
嗎福啉-1-基羰基、硫嗎福啉-1-基羰基、
 COOH 、 $\text{(C}_1\text{-C}_4\text{-烷氧基)羰基}$ 、 $\text{CO}_2\text{(CH}_2\text{)}_m\text{O-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、
 $\text{NHCO-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 $\text{NHCO-(C}_1\text{-C}_4\text{-鹵烷基)}$ 、 $\text{N-(C}_1\text{-C}_3\text{-烷基)-CO-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、
 $\text{N-(C}_1\text{-C}_3\text{-烷基)-CS-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 $\text{NHCO-(C}_2\text{-C}_4\text{-烯基)}$ 、
 $\text{NH(C=S)O-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 NHCOPh 、 $\text{NHCO(CH}_2\text{)}_m\text{O-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、
 NHCHO 、 $\text{N-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)CHO}$ 、 $\text{NHCO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 NHCO_2Ph 、
 $\text{NHCO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_2\text{-鹵烷基)}$ 、 $\text{N-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)-CO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 NH_2 、
 $\text{NH-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 $\text{N-(C}_1\text{-C}_2\text{-烷基)}_2$ 、環丙基胺基、
 $\text{NHCH(CH}_3\text{)CH}_2\text{OCH}_3$ 、乙醯基(環丙基)胺基、[(1-甲基環丙

基)羰基]胺基、嗎福啉-1-基、嗎福啉-4-基甲基、
 $\text{NH}\text{SO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 CH_2CN 、 CHMeCN 、
 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NH-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{N-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}_2$ 、
 $\text{C(Me)HSO}_2\text{N-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CO-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、
 $\text{CH(CH}_3\text{)COCH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{CO-(C}_3\text{-C}_6\text{-環烷基)}$ 、
 $\text{CH}_2\text{CONH-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、
 $\text{CH}_2\text{NHCOO-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 $\text{CH=NO-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、
 $\text{C(CH}_3\text{)=NO-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、 $\text{CH}_2\text{NHCO-(C}_1\text{-C}_4\text{-烷基)}$ 、
 $\text{CH}_2\text{NHCO-(C}_1\text{-C}_4\text{-鹵烷基)}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_6\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_3\text{-C}_6\text{-環烷基}$ 、1-
 甲氧基環丙基、1-氯環丙基、 $\text{C}_2\text{-C}_6\text{-烯基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-鹵烷基}$ 、
 嗎福啉-4-基磺醯基、(3-甲基-2,5-二酮基咪唑啉-1-基)、3-
 甲基-2-酮基咪唑啉-1-基、(3-甲基-2-酮基咪唑啉-1-基)甲基、
 六氫吡啶-1-基磺醯基、1,3-噻唑-2-基、1,3-噻唑-4-基、3,5-
 二甲基六氫吡啶-1-基、4-(第三丁氧基羰基)六氫吡啶-1-基、
 5-乙氧基-3,4-二甲基-1H-吡唑-1-基、乙醯基(環己基)胺基、
 2-呋喃甲醯基胺基、5-乙氧基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基、
 3-(2-氯乙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、1,1-二氧基異噻唑啉-2-
 基、1,1-二氧基四氫噻吩-2-基、4-甲基-5-酮基-4,5-二氫
 -1H-1,2,4-三唑-1-基、3-甲基-5-酮基-2,5-二氫-1H-吡唑-1-
 基、2-(甲氧基甲基)吡咯啉-1-基、2-酮基環戊基、2-酮基四
 氫呋喃-3-基、1-甲基-3-酮基-2,3-二氫-1H-吡唑-4-基、1-甲
 基-3-酮基吡唑啉-4-基、四氫呋喃-2-基、呋喃-2-基、5-甲
 基-1,1-二氧基-1,2,5-噻二唑啉-2-基、(苄基胺磺醯基)甲基、
 (呋喃-2-基羰基)胺基、[(1-苯基乙基)胺磺醯基]甲基、5-酮

基-3-(丙-2-基)-4,5-二氫-1H 吡唑-1-基、5-酮基-3-(三氟甲基)-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、1H-四唑-5-基、(環丙基羰基)胺基、4,4-二甲基-2,5-二酮基咪唑啉-1-基、2,3-二甲基-5-酮基-2,5-二氫-1H-吡唑-1-基、5-噻酮基-4,5-二氫-1H-四唑-1-基、3-(1-甲基乙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、3-(2-甲基丙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、2-酮基-3-丙-2-烯-1-基咪唑啉-1-基、3-第三丁基-2-酮基咪唑啉-1-基、吡咯啉-1-基磺醯基、2,5-二酮基咪唑啉-4-基、(嗎福啉-4-基磺醯基)甲基、(六氫吡啶-1-基磺醯基)甲基、(吡咯啉-1-基磺醯基)甲基、2-酮基咪唑啉-1-基、3-甲基-5-酮基-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、3,4-二甲基-5-酮基-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、1-甲基環戊基、吡咯啉-1-基、六氫吡啶-1-基、2-酮基-2,5-二氫-1H-吡咯-1-基、3,3-二甲基-2-酮基環戊基、3-酮基-4,5-二甲基-2,4-二氫-吡唑-2-基、3-酮基-4-乙基-5-甲基-2,4-二氫吡唑-2-基、3-酮基-5-三氟甲基-2,4-二氫吡唑-2-基、3-酮基-5-異丙基-2,4-二氫吡唑-2-基、3,5-二酮基-4,4-二甲基吡唑啉-1-基、3,5-二酮基-4-乙基吡唑啉-1-基、3-酮基-4,4-二甲基吡唑啉-1-基、2,5-二酮基-2,5-二氫-1H-吡咯-1-基、3-酮基丁基、4-甲氧基-2-酮基-2,5-二氫-1H-吡咯-1-基、2-酮基-2,5-二氫-1H-吡咯-1-基、5-酮基-4,5-二氫-1H-咪唑-1-基、1,1-二氧基-1,2-噻吡-2-基、6-甲基-1,1-二氧基-1,2,6-噻二吡-2-基、環丙基(三氟乙醯基)胺基，其中 $m=1-3$ ，

而且，如果 R^3 及 R^4 ，如果適當時經由 R^{12} 或 R^{13} 形成環，下面通式(I)的次單元：



可以是(2-酮基-2,3-二氫-1H-吡啶-5-基)胺基、1H-吡啶-6-基胺基、1H-吡啶-5-基胺基、2-[(三氟甲基)-1H-苯並咪唑-6-基]胺基、(3-甲基-1,1-二氧基-2H-1,2,4-苯並噻二吡-7-基)胺基、(1,1-二氧基-2H-1,2,4-苯並噻二吡-6-基)胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-6-基)胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-7-基)胺基、(1-乙醯基-2,3-二氫-1H-吡啶-6-基)胺基、(4H-1,3-苯並二氧芑-7-基)胺基、(2-酮基-2,3,4,5-四氫-1H-1-苯並吡啶-8-基)胺基、(2,2-二氧基-1,3-二氫-2-苯並噻吩-5-基)胺基、(1-酮基-2,3-二氫-1H-茛-5-基)胺基、[2-(乙基磺醯基)-2,3-二氫-1,3-苯並噻唑-6-基]胺基、(2,2,3,3-四氟-2,3-二氫-1,4-苯並二氧芑-6-基)胺基、1,3-苯並二噁茂-5-基胺基、(1,3-二酮基-2,3-二氫-1H-異吡啶-5-基)胺基、(2-甲基-1,3-苯並噻唑-6-基)胺基、(2-酮基-2,3-二氫-1H-苯並咪唑-5-基)胺基、(2-酮基-1,3-苯並噁噻-5-基)胺基、(2-酮基-2,3-二氫-1,3-苯並噁唑-5-基)胺基、(2-乙基-1,3-苯並噁唑-5-基)胺基、(2-酮基-1,2,3,4-四氫喹啉-6-基)胺基、(3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-6-基)胺基、(2-酮基-2,3-二氫-1,3-苯並噁唑-6-基)胺基、3-酮基-1,3-二氫-2-苯並呋喃-5-基)胺基、[2-(乙基磺醯基)-1,3-苯並噻唑-6-基]胺基、(2-甲基-1,3-苯並噻唑-5-基)胺基、(1-乙醯基-2,3-二氫-1H-吡啶-5-基)胺基、(2,2,3,3-四氟-2,3-二氫-1,4-苯並二氧芑-6-基)胺基、(2,2-二氧基-1,3-二氫-2-苯並噻吩-5-基)胺基、(2-酮基-2,3-二氫-1H-吡啶-6-基)胺基、(2-酮基

-1,2,3,4-四氫喹啉-7-基)胺基、1H-吡啶-6-基胺基，

R^6 代表氫、 C_1 - C_3 -烷基、 CH_2OCH_3 、 $CH_2CH_2OCH_3$ 、甲醯基、
(C_1 - C_4 -烷基)羰基、(C_1 - C_4 -鹵烷基)羰基、(C_1 - C_4 -烷氧基)羰基、
苄氧基羰基、苄基、4-甲氧基苄基、2,4-二甲氧基苄基、
2-羥基苄基、未經取代或經取代之苯甲醯基、未經取代或
經取代之 C_2 - C_4 -烯基、未經取代或經取代之 C_2 - C_4 -炔基、
 C_1 - C_2 -烷基亞磺醯基或 C_1 - C_2 -烷基磺醯基，

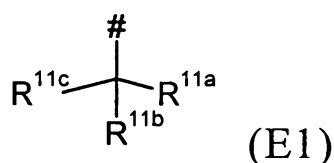
其中取代基是彼此獨立地選自包括氫、氟、氯及溴、 C_1 - C_2 -
烷基、 C_1 - C_2 -鹵烷基及氰基，

R^7 代表氫、甲基、氰基、 CF_3 、 CFH_2 或 CF_2H ，

R^8 代表氯、溴、碘、氰基、Me、SMe、SOMe、 SO_2Me 、
 CFH_2 、 CF_2H 或 CF_3 ，

R^9 代表氫、甲基、乙基、丙-1-基、 CH_2CH_2OMe 或
 $CH_2CH=CH_2$ ，

R^{10} 代表式 E1 之基



其中符號定義如下且 # 代表連接至氮原子的點：

R^{11a} 代表氫或甲基，

R^{11b} 代表氫或 C_1 - C_3 -烷基，

R^{11c} 代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、CN、 CH_2CN 、 $CH(Me)CN$ 、
 $C(Me)_2CN$ 、 CH_2OH 、 $CH_2O-(C_1-C_3-烷基)$ 、 $CH_2O-(C_1-C_3-鹵$
烷基)、 $C(Me)HOH$ 、 $C(Me)_2OH$ 、 $C(Me)HO-(C_1-C_3-烷基)$ 、
 $C(Me)_2O-(C_1-C_3-烷基)$ 、 $C(Me)HO-(C_1-C_2-鹵烷基)$ 、

$C(Me)_2O-(C_1-C_2\text{-鹵烷基})$ 、 $CH_2S-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、
 $C(Me)HS-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $C(Me)_2S-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $Si(C_1-C_2\text{-烷基})_3$ 或 $C_2-C_4\text{-烯基}$ 其是隨意地經鹵基或 CF_3 取代；

或

R^{10} 代表環戊基或環己基環其可隨意地經 CN 、鹵基、 $C_1-C_3\text{-烷基}$ 、 $C_1-C_3\text{-烷氧基}$ 、 $C_1-C_3\text{-鹵烷基}$ 、 $C_1-C_3\text{-鹵烷氧基}$ 或 $C_1-C_3\text{-烷氧基}-C_1-C_3\text{-烷基}$ 單-或多取代，
 及這些化合物之農藝化學活性鹽類。

特別較宜是使用其中一或多個符號具有其中一個下面意義之式(I)化合物作為殺真菌劑：

X^1 代表氮或 CR^3 ，

X^2 代表氮或 CR^4 ，

其中 X^1 及 X^2 不都代表氮，

R^1 及 R^5 彼此獨立地代表氫、 $C_1-C_2\text{-烷基}$ 、 $C_1-C_2\text{-烷氧基}$ 、 F 或 Cl ，

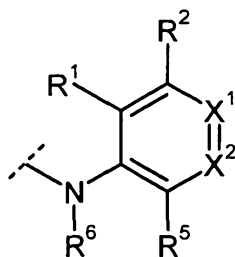
R^2 代表氫、氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、 $C_1-C_3\text{-烷基}$ 、 $C_1-C_2\text{-鹵烷基}$ 、羥基、 $C_1-C_3\text{-烷氧基}$ 、 $OCH_2CH=CH_2$ 、 $OCH_2C\equiv CH$ 、 $CONHMe$ 、 $C_1-C_2\text{-鹵烷氧基}$ 、 $COMe$ 、 COH 、 $COEt$ 、 $CMe(=NOH)$ 、 $CMe(=NOMe)$ 、 SF_5 、 $S-(C_1-C_3)\text{-烷基}$ 、 SCF_3 、 SCF_2H 、 $SOMe$ 、 SO_2Me 、 $CO_2-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 NH_2 、 $NH-(C_1-C_2\text{-烷基})$ 、 $N-(C_1-C_2\text{-烷基})_2$ 、 $NHCO-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $NHCOH$ 、 $NMeCO-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $NHCO_2-(C_1-C_3\text{-烷基})$ ，

R^3 及 R^4 彼此獨立地代表氫、氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、羥基、 $O-(C_1-C_4\text{-烷基})$ 、 $O\text{-環戊基}$ 、 OCF_3 、 OCF_2H 、 OCF_2CF_3 、

$\text{OCF}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 $\text{OCONH}-(\text{C}_1-\text{C}_3\text{-烷基})$ 、 $\text{OCON}-(\text{C}_1-\text{C}_3\text{-烷基})_2$ 、
 $\text{OCO}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})$ 、 SH 、 SF_5 、 $\text{S}-\text{C}_1-\text{C}_3\text{-烷基}$ 、 SCF_3 、 SCF_2H 、
 SPh 、 SOMe 、 SO_2Me 、 $\text{SO}_2\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{SO}_2\text{CH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、
 SO_2CF_3 、 SO_2NMe_2 、甲醯基、 $\text{CO}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})$ 、 COCF_3 、
 COCH_2CN 、 $\text{CONH}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})$ 、 $\text{CON}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})_2$ 、
 $\text{CONHCH}_2\text{CF}_3$ 、 $\text{CONHCH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ 、 $\text{CONHCH}_2\text{C}\equiv\text{CH}$ 、
 $\text{CONHCH}_2\text{C}(\text{=CH}_2)\text{CH}_3$ 、 $\text{CONHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{OCH}_3$ 、
 $\text{CONH}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、 CONHPh 、 CONH-環丙基 、六氫吡啶-1-
 基羰基、嗎福啉-4-基羰基、(4-甲基六氫吡啶-1-基)羰基、
 COOH 、 $(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷氧基})$ 羰基、 $\text{CO}_2(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、
 $\text{NHCO}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})$ 、 NHCOCF_3 、 $\text{N}(\text{C}_2\text{H}_5)\text{COMe}$ 、
 $\text{NHCOCH}=\text{CH}_2$ 、 NHCOPh 、 $\text{NHCOC}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{F}$ 、
 $\text{NHCOC}(\text{CH}_3)_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $\text{NHCO}(\text{C}=\text{CH}_2)\text{CH}_3$ 、 $\text{NHCOCH}_2\text{OCH}_3$ 、
 $\text{NHCO}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、 $\text{N}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$ 、 NHCHO 、 NMeCHO 、
 $\text{NHCO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})$ 、 NHCO_2Ph 、 $\text{NHCO}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Cl}$ 、
 NMeCO_2Me 、 NH_2 、 $\text{NH}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})$ 、 $\text{N}-(\text{C}_1-\text{C}_2\text{-烷基})_2$ 、環
 丙基胺基、 $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{OCH}_3$ 、乙醯基(環丙基)胺基、[(1-
 甲基環丙基)羰基]胺基、嗎福啉-1-基、嗎福啉-4-基甲基、
 NHSO_2Me 、 CH_2CN 、 CHMeCN 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NH}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})$ 、
 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{N}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})_2$ 、 $\text{C}(\text{Me})\text{HSO}_2\text{N}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})_2$ 、
 CH_2COCH_3 、 $\text{CH}_2\text{COtertBu}$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$ 、
 $\text{CH}_2\text{COCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CO-環丙基}$ 、 $\text{CH}_2\text{CONHtertBu}$ 、
 $\text{CH}_2\text{CO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})$ 、 $\text{CH}_2\text{NHCOOMe}$ 、 $\text{CH}=\text{NOMe}$ 、
 $\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NOMe}$ 、 $\text{CH}=\text{NOEt}$ 、 $\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NOEt}$ 、 CH_2NHAc 、

$\text{CH}_2\text{NHCOCF}_3$ 、 C_1 - C_4 -烷基、 C_3 - C_6 -環烷基、1-甲氧基環丙基、1-氯環丙基、3,3-二甲基丁基、新戊基、 C_2 - C_4 -烯基、 C_1 - C_2 -鹵烷基、嗎福啉-4-基磺醯基、3-甲基-2,5-二酮基咪唑啉-1-基、3-甲基-2-酮基咪唑啉-1-基、(3-甲基-2-酮基咪唑啉-1-基)甲基、六氫吡啶-1-基磺醯基、1,3-噻唑-2-基、1,3-噻唑-4-基、3,5-二甲基六氫吡啶-1-基、4-(第三丁氧基羰基)六氫吡啶-1-基、5-乙氧基-3,4-二甲基-1H-吡唑-1-基、乙醯基(環己基)胺基、2-呋喃甲醯基胺基、(2,2,2-三氟乙基)胺磺醯基、5-乙氧基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基、3-(2-氯乙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、1,1-二氧基異噻唑啉-2-基、1,1-二氧基四氫噻吩-2-基、4-甲基-5-酮基-4,5-二氫-1H-1,2,4-三唑-1-基、3-甲基-5-酮基-2,5-二氫-1H-吡唑-1-基、2-(甲氧基甲基)吡咯啉-1-基、2-酮基環戊基、2-酮基四氫呋喃-3-基、1-甲基-3-酮基-2,3-二氫-1H-吡唑-4-基、1-甲基-3-酮基吡唑啉-4-基、四氫呋喃-2-基、呋喃-2-基、5-甲基-1,1-二氧基-1,2,5-噻二唑啉-2-基、(2,2-二甲基丙醯基)(甲基)胺基、(二甲基胺磺醯基)甲基、(苄基胺磺醯基)甲基、(呋喃-2-基羰基)胺基、[(1-苯基乙基)胺磺醯基]甲基、5-酮基-3-(丙-2-基)-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、5-酮基-3-(三氟甲基)-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、(環丙基羰基)胺基、4,4-二甲基-2,5-二酮基咪唑啉-1-基、3-(1-甲基乙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、3-(2-甲基丙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、2-酮基-3-丙-2-烯-1-基咪唑啉-1-基、3-第三丁基-2-酮基咪唑啉-1-基、吡咯啉-1-基磺醯基、2,5-二酮基咪唑啉-4-基、(嗎福啉-4-基磺醯基)甲基、(六氫吡啶-1-基磺

鹽基)甲基、(吡咯啉-1-基磺鹽基)甲基、2-酮基咪唑啉-1-基、
 3-甲基-5-酮基-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、3,4-二甲基-5-酮基
 -4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、1-甲基環戊基、吡咯啉-1-基、六
 氫吡啶-1-基、2-酮基-2,5-二氫-1H-吡咯-1-基、3,3-二甲基-2-
 酮基環戊基、3-酮基-4,5-二甲基-2,4-二氫吡唑-2-基、3-酮
 基-4-乙基-5-甲基-2,4-二氫吡唑-2-基、3,5-二酮基-4-乙基吡
 唑啉-1-基、3-酮基-4,4-二甲基吡唑啉-1-基、2,5-二酮基-2,5-
 二氫-1H-吡咯-1-基、4-甲氧基-2-酮基-2,5-二氫-1H-吡咯-1-
 基、2-酮基-2,5-二氫-1H-吡咯-1-基、5-酮基-4,5-二氫-1H-
 咪唑-1-基、1,1-二氧基-1,2-噻吡-2-基、6-甲基-1,1-二氧基
 -1,2,6-噻二吡-2-基、環丙基(三氟乙鹽基)胺基，
 而且，如果 R^3 及 R^4 ，如果適當時經由 R^{12} 或 R^{13} 形成環，
 下面通式(I)的次單元：



可以是(2-酮基-2,3-二氫-1H-吡啶-5-基)胺基、1H-吡啶-6-
 基胺基、1H-吡啶-5-基胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫
 -2H-1,4-苯並噁吡-6-基)胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫
 -2H-1,4-苯並噁吡-7-基)胺基、(1-乙鹽基-2,3-二氫-1H-吡啶
 -6-基)胺基、(1-乙鹽基-2,3-二氫-1H-吡啶-5-基)胺基、(2-酮
 基-2,3,4,5-四氫-1H-1-苯並吡啶-8-基)胺基、1,3-苯並二噁
 茂-5-基胺基、(1,3-二酮基-2,3-二氫-1H-異吡啶-5-基)胺基、

(2-酮基-2,3-二氫-1,3-苯並呋唑-5-基)胺基、(2-乙基-1,3-苯並呋唑-5-基)胺基、(2-酮基-1,3-苯並噁嗪-5-基)胺基、(2-酮基-1,2,3,4-四氫喹啉-6-基)胺基、(3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並呋喃-6-基)胺基、(2-酮基-2,3-二氫-1,3-苯並呋唑-6-基)胺基、[2-(乙基磺醯基)-1,3-苯並噁嗪-6-基]胺基、(2-甲基-1,3-苯並噁嗪-5-基)胺基、(2,2,3,3-四氟-2,3-二氫-1,4-苯並二氧芑-6-基)胺基、(3-酮基-1,3-二氫-2-苯並呋喃-5-基)胺基、(2,2-二氧基-1,3-二氫-2-苯並噁吩-5-基)或(1-酮基-2,3-二氫-1H-茛-5-基)胺基，

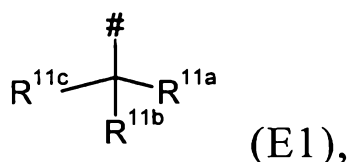
R^6 代表氫、Me、乙基、丙基、甲醯基、 CH_2OCH_3 、 COMe 、 COCF_3 、 COOMe 、 COOEt 、 $\text{COO}t\text{ertBu}$ 、苄氧基羰基、苄基、苯甲醯基或 2-甲基苯甲醯基，

R^7 代表氫、甲基或 CF_3 ，

R^8 代表氯、溴、 CF_3 、Me、氰基、碘、 CFH_2 、 CF_2H 、 SMe 、 SOMe 或 SO_2Me ，

R^9 代表氫、甲基、乙基、丙-1-基、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OMe}$ 或 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$ ，

R^{10} 代表式 E1 之基



其中符號定義如下且 # 代表連接至氮原子的點：

R^{11a} 代表氫或甲基，

R^{11b} 代表氫或 C_1 - C_3 -烷基，

R^{11c} 代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、CN、 CH_2CN 、 $CH(Me)CN$ 、 CH_2OH 、 $CH_2O-(C_1-C_2\text{-烷基})$ 、 $CH_2O-(C_1-C_2\text{-鹵烷基})$ 、 $C(Me)HOH$ 、 $C(Me)_2OH$ 、 $C(Me)HO-(C_1-C_2\text{-烷基})$ 、 $C(Me)_2O-(C_1-C_2\text{-烷基})$ 、 $CH_2S-(C_1-C_2\text{-烷基})$ 、 $C(Me)HS-(C_1-C_2\text{-烷基})$ 、 $C(Me)_2S-(C_1-C_2\text{-烷基})$ 、 $SiMe_3$ 或 C_2 - C_4 -烯基其是隨意地經鹵基或 CF_3 取代；

或

R^{10} 代表環戊基或環己基環其可隨意地經 CN、鹵基、Me、Et、OMe、 CF_3 、 OCF_3 、 CH_2OCH_3 單-或多取代，及這些化合物之農藝化學活性鹽類。

非常特別較宜使用其中一或多個符號是定義如下的式
(I)化合物作為殺真菌劑：

X^1 代表氮或 CR^3 ，

X^2 代表氮或 CR^4 ，

其中 X^1 及 X^2 不都代表氮，

R^1 及 R^5 彼此獨立地代表氫、甲基、甲氧基或 F，

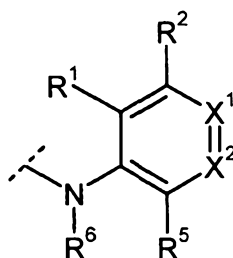
R^2 代表氫、氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、甲基、乙基、丙基、丙-2-基、 CF_3 、 CF_2H 、 CFH_2 、 CF_2CF_3 、羥基、OMe、OEt、OPr、OisoPr、 $OCH_2CH=CH_2$ 、 $OCH_2C\equiv CH$ 、 $CONHMe$ 、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 OCF_2CF_2H 、COMe、COH、COEt、 $C(=NOH)Me$ 、 $C(=NOMe)Me$ 、 SF_5 、SMe、SEt、SPr、SiPr、 SCF_3 、 SCF_2H 、SOMe、 SO_2Me 、 CO_2CH_3 、 CO_2Et 、NHMe、 NMe_2 、NHEt、 NEt_2 、 $NHCOMe$ 、 $NHCOH$ 、 $NMeCOMe$ 、 $NHCO_2Me$ 或 $NHCO_2Et$ ，

R^3 及 R^4 彼此獨立地代表氫、氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、
 羥基、OMe、OEt、OPr、O*iso*Pr、OBu、O*sec*Bu、O*iso*Bu、
 O*tert*Bu、O-環戊基、OCF₃、OCF₂HOCF₂CF₃、OCF₂CF₂H、
 OCONHMe、OCONHEt、OCONHPr、OCONH*iso*Pr、
 OCONMe₂、OCONEt₂、OCONPr₂、OCON*iso*Pr₂、OCOMe、
 OCOEt、OCOBu、SH、SF₅、SMe、SEt、SPr、SiPr、SCF₃、
 SCF₂H、SPh、SOMe、SO₂Me、SO₂CH₂CH=CH₂、
 SO₂CH₂C≡CH、SO₂CF₃、SO₂NMe₂、甲醯基、COMe、COEt、
 COPr、CO*iso*Pr、COCF₃、COCH₂CN、CONHMe、CONMe₂、
 CONHEt、CONHCH₂CF₃、CONEt₂、CONHPr、CONH*iso*Pr、
 CONHBu、CONH*tert*Bu、CONHCH₂CH=CH₂、
 CONHCH₂C≡CH、CONHCH₂C(=CH₂)CH₃、
 CONHCH(CH₃)CH₂OCH₃、CONH(CH₂)₂OCH₃、CONHPh、
 CONH-環丙基、六氫吡啶-1-基羰基、嗎福啉-4-基羰基、(4-
 甲基六氫吡啶-1-基)羰基、COOH、CO₂CH₃、CO₂Et、CO₂Pr、
 CO₂*iso*Pr、CO₂(CH₂)₂OCH₃、NHCOMe、NHCOEt、NHCOPr、
 NHCO*iso*Pr、NHCOBu、NHCO*iso*Bu、NHCOCF₃、
 NHC*sec*Bu、NHC*tert*Bu、N(C₂H₅)COMe、NHC₂H₅CH=CH₂、
 NHCOPh、NHCOC(CH₃)₂CH₂F、NHCOC(CH₃)₂CH₂Cl、
 NHCOC(C=CH₂)CH₃、NHC₂H₅CH₂OCH₃、NHC(CH₂)₂OCH₃、
 N(CH₃)COCH₃、NHCHO、NMeCHO、NHCO₂Me、NHCO₂Et、
 NHCO₂*iso*Pr、NHCO₂*tert*Bu、NHCO₂*iso*Bu、NHCO₂*sec*Bu、
 NHCO₂*n*Bu、NHCO₂Ph、NHCO₂CH₂CH₂Cl、NMeCO₂Me、
 NH₂、NHMe、NMe₂、NHEt、NEt₂、NHPr、NH*iso*Pr、NH*n*Bu、

環丙基胺基、 $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{OCH}_3$ 、乙醯基(環丙基)胺基、
 [(1-甲基環丙基)羰基]胺基、嗎福啉-1-基、嗎福啉-4-基-甲
 基、 $\text{NH}\text{SO}_2\text{Me}$ 、 CH_2CN 、 CHMeCN 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NHMe}$ 、
 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NHPr}$ 、 CH_2COCH_3 、 $\text{CH}_2\text{COtertBu}$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$ 、
 $\text{CH}_2\text{COCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 CH_2CO -環丙基、 $\text{CH}_2\text{CONHtertBu}$ 、
 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{NHCOOMe}$ 、 $\text{CH}=\text{NOMe}$ 、
 $\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NOMe}$ 、 $\text{CH}=\text{NOEt}$ 、 $\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NOEt}$ 、 CH_2NHAc 、
 $\text{CH}_2\text{NHCOCF}_3$ 、甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、
 1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、環丙基、1-甲
 氧基環丙基、1-氯環丙基、環丁基、3,3-二甲基丁基、環戊
 基、環己基、新戊基、丙-2-烯-1-基、1-甲基丙-2-烯-1-基、
 丁-3-烯-1-基、 CF_3 、 CF_2H 、 CF_2CF_3 、嗎福啉-4-基磺醯基、
 3-甲基-2,5-二酮基咪唑啉-1-基、3-甲基-2-酮基咪唑啉-1-基、
 (3-甲基-2-酮基咪唑啉-1-基)甲基、六氫吡啶-1-基磺醯基、
 1,3-噻唑-2-基、1,3-噻唑-4-基、3,5-二甲基六氫吡啶-1-基、
 4-(第三丁氧基羰基)六氫吡啶-1-基、5-乙氧基-3,4-二甲基
 -1H-吡唑-1-基、乙醯基(環己基)胺基、2-呋喃甲醯基胺基、
 (2,2,2-三氟乙基)胺磺醯基、5-乙氧基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑
 -1-基、3-(2-氯乙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、1,1-二氧基異噻唑
 啉-2-基、1,1-二氧基四氫噻吩-2-基、4-甲基-5-酮基-4,5-二
 氫-1H-1,2,4-三唑-1-基、3-甲基-5-酮基-2,5-二氫-1H-吡唑-1-
 基、2-(甲氧基甲基)吡咯啉-1-基、2-酮基環戊基、2-酮基四
 氫呋喃-3-基、1-甲基-3-酮基-2,3-二氫-1H-吡唑-4-基、1-甲
 基-3-酮基吡唑啉-4-基、四氫呋喃-2-基、呋喃-2-基、5-甲基

-1,1-二氧基-1,2,5-噻二唑啉-2-基、(2,2-二甲基丙醯基)(甲基)胺基、(苄基胺磺醯基)甲基、(二甲基胺磺醯基)甲基、(呋喃-2-基羰基)胺基、[(1-苯基乙基)胺磺醯基]甲基、[乙基(甲基)胺磺醯基]甲基、[甲基(丙-2-基)胺磺醯基]甲基、5-酮基-3-(丙-2-基)-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、5-酮基-3-(三氟甲基)-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、(環丙基羰基)胺基、3-(1-甲基乙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、3-(2-甲基丙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、2-酮基-3-丙-2-烯-1-基咪唑啉-1-基、3-第三丁基-2-酮基咪唑啉-1-基、吡咯啉-1-基磺醯基、2,5-二酮基咪唑啉-4-基、(嗎福啉-4-基磺醯基)甲基、(六氫吡啶-1-基磺醯基)甲基、(吡咯啉-1-基磺醯基)甲基、2-酮基咪唑啉-1-基、3,3-二甲基-2-酮基環戊基、3-酮基-4,5-二甲基-2,4-二氫吡唑-2-基、3,5-二酮基-4-乙基吡唑啉-1-基、5-酮基-4,5-二氫-1H-咪唑-1-基、1,1-二氧基-1,2-噻吡-2-基、6-甲基-1,1-二氧基-1,2,6-噻二吡-2-基、環丙基(三氟乙醯基)胺基，

而且，如果 R^3 及 R^4 ，如果適當時經由 R^{12} 或 R^{13} 形成環，下面通式(I)的次單元：



可以是(2-酮基-2,3-二氫-1H-吡啶-5-基)胺基、1H-吡啶-6-基胺基、1H-吡啶-5-基胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噁吡-6-基)胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並

𠵿𠵿-7-基)胺基、(1-乙醯基-2,3-二氫-1H-𠵿𠵿-6-基)胺基、
 (1-乙醯基-2,3-二氫-1H-𠵿𠵿-5-基)胺基、(2-酮基-2,3,4,5-四
 氫-1H-1-苯並𠵿庚因-8-基)胺基、1,3-苯並二𠵿茂-5-基胺基、
 (1,3-二酮基-2,3-二氫-1H-異𠵿𠵿-5-基)胺基、(2-酮基-2,3-
 二氫-1,3-苯並𠵿唑-5-基)胺基、(2-乙基-1,3-苯並𠵿唑-5-基)
 胺基、(2-酮基-1,3-苯並𠵿噻-5-基)胺基、(2-酮基-1,2,3,4-四
 氫𠵿啉-6-基)胺基、(3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並𠵿𠵿-6-
 基)胺基、(2-酮基-2,3-二氫-1,3-苯並𠵿唑-6-基)胺基、[2-(乙
 基磺醯基)-1,3-苯並𠵿噻-6-基]胺基、(2-甲基-1,3-苯並𠵿噻
 -5-基)胺基、(2,2,3,3-四氟-2,3-二氫-1,4-苯並二𠵿𠵿-6-基)
 胺基、(3-酮基-1,3-二氫-2-苯並𠵿喃-5-基)胺基、(2,2-二𠵿
 基-1,3-二氫-2-苯並𠵿吩-5-基)或(1-酮基-2,3-二氫-1H-𠵿-5-
 基)胺基,

R^6 代表氫、Me、甲醯基、COMe、COCF₃、COOMe 或 COOEt,
 R^7 代表氫,

R^8 代表氯、溴、CF₃、Me、𠵿基、碘、CFH₂、SMe、SOMe
 或 SO₂M,

R^9 代表氫、甲基、乙基、丙-1-基、CH₂CH₂OMe 或
 CH₂CH=CH₂,

R^{10} 代表甲基、乙基、丙基、丙-2-基、丁基、丁-2-基、2-
 甲基丙基、第三丁基、戊基、3-甲基丁基、2-甲基丁基、2,2-
 二甲基丙基、戊-2-基、戊-3-基、4-甲基戊-2-基、己-3-基、
 3,3-二甲基丁-2-基、2,4-二甲基戊-3-基、環戊基、2-甲基環
 戊基、2-乙基環戊基、2-氯環戊基、2-𠵿環戊基、2-𠵿基環

戊基、2-甲氧基環戊基、2-(甲氧基甲基)環戊基、環己基、2-甲氧基環己基、2-甲基環己基、4,4-二氟環己基、4-(三氟甲基)環己基、丙-2-烯-1-基、2-甲基丙-2-烯-1-基、1-甲基丙-2-烯-1-基、3-甲基丁-2-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、4,4,4-三氟丁-2-烯-1-基、3-氟丁-2-烯-1-基、2-氟丙-2-烯-1-基、氰基甲基、2-氰基乙基、1-氰基丙-2-基、3-氰基丁-2-基、(三甲基矽烷基)甲基、1-(三甲基矽烷基)乙基、2-羥基乙基、2-甲氧基乙基、2-乙氧基乙基、2-(三氟甲氧基)乙基、1-羥基丙-2-基、1-羥基丁-2-基、3-羥基-3-甲基丁-2-基、2-羥基-2-甲基丙基、3-甲氧基-3-甲基丁-2-基、2-甲氧基-2-甲基丙基、1-甲氧基丙-2-基、1-乙氧基丙-2-基、1-三氟甲氧基丙-2-基、1-甲氧基丁-2-基、3-甲氧基丁-2-基、1-甲氧基-3-甲基丁-2-基、1-甲氧基戊-2-基、2-(甲基胺磺醯基)乙基、(2R)-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基、(2S)-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基、2-甲基-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基，
及這些化合物之農藝化學活性鹽類。

特別較宜是使用其中一或多個符號具有其中一個下面意義之式(I)化合物作為殺真菌劑：

X^1 代表 CR^3 ，

X^2 代表氮或 CR^4 ，

R^1 及 R^5 彼此獨立地代表氫、甲基、甲氧基或 F，

R^2 代表氫、氟、氯、溴、氰基、甲基、乙基、丙基、丙-2-基、 CF_3 、羥基、OMe、OEt、 OCF_3 、COMe、COEt、SMe、SEt、 CO_2CH_3 、 CO_2Et 、NHMe、 NMe_2 、NHet、 NEt_2 或

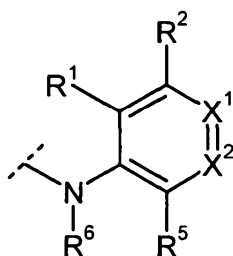
NHCOMe,

R^3 及 R^4 彼此獨立地代表氫、氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、
 羥基、OMe、OEt、OPr、OisoPr、OBu、OsecBu、OisoBu、
 OtertBu、O-環戊基、OCF₃、OCF₂CF₃、OCF₂CF₂H、
 OCONHMe、OCONHEt、OCONHPr、OCONHisoPr、
 OCONMe₂、OCONEt₂、OCONPr₂、OCONisoPr₂、OCOMe、
 OCOEt、OCOBu、SH、SF₅、SMe、SEt、SPr、SiPr、SCF₃、
 SCF₂H、SPh、SO₂Me、SO₂CF₃、SO₂NMe₂、甲醯基、COMe、
 COEt、COPr、COisoPr、COCF₃、COCH₂CN、CONHMe、
 CONMe₂、CONHEt、CONHCH₂CF₃、CONEt₂、CONHPr、
 CONHisoPr、CONHBu、CONHtertBu、CONHCH₂CH=CH₂、
 CONHCH₂C≡CH、CONHCH₂C(=CH₂)CH₃、
 CONHCH(CH₃)CH₂OCH₃、CONH(CH₂)₂OCH₃、CONHPh、
 CONH-環丙基、六氫吡啶-1-基羰基、嗎福啉-4-基羰基、
 COOH、CO₂CH₃、CO₂Et、CO₂Pr、CO₂isoPr、CO₂(CH₂)₂OCH₃、
 NHCOMe、NHCOEt、NHCOPr、NHCOisoPr、NHCOBu、
 NHCOisoBu、NHCOCF₃、NHCOfsecBu、NHCOftertBu、
 N(C₂H₅)COMe、NHCOCH=CH₂、NHCOPh、
 NHCOC(CH₃)₂CH₂F、NHCOC(CH₃)₂CH₂Cl、
 NHCO(C=CH₂)CH₃、NHCOCH₂OCH₃、NHCO(CH₂)₂OCH₃、
 N(CH₃)COCH₃、NHCHO、NMeCHO、NHCO₂Me、NHCO₂Et、
 NHCO₂isoPr、NHCO₂tertBu、NHCO₂isoBu、NHCO₂secBu、
 NHCO₂nBu、NHCO₂Ph、NHCO₂CH₂CH₂Cl、NMeCO₂Me、
 NH₂、NHMe、NMe₂、NHEt、NEt₂、NHPr、NHisoPr、NHnBu、

環丙基胺基、 $\text{NHCH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{OCH}_3$ 、乙醯基(環丙基)胺基、
 [(1-甲基環丙基)羰基]胺基、嗎福啉-1-基、嗎福啉-4-基甲基、
 NHSO_2Me 、 CH_2CN 、 CHMeCN 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NHMe}$ 、
 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NHPr}$ 、 CH_2COCH_3 、 $\text{CH}_2\text{COtertBu}$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$ 、
 $\text{CH}_2\text{COCH}(\text{CH}_3)_2$ 、 CH_2CO -環丙基、 $\text{CH}_2\text{CONHtertBu}$ 、
 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 $\text{CH}_2\text{NHCOOMe}$ 、 CH_2NHAc 、
 $\text{CH}_2\text{NHCOCF}_3$ 、甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、
 1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、環丙基、1-甲
 氧基環丙基、1-氯環丙基、環丁基、3-二甲基丁基、環戊基、
 環己基、新戊基、丙-2-烯-1-基、1-甲基丙-2-烯-1-基、丁-3-
 烯-1-基、 CF_3 、 CF_2H 、嗎福啉-4-基磺醯基、3-甲基-2,5-二
 酮基咪唑啉-1-基、3-甲基-2-酮基咪唑啉-1-基、(3-甲基-2-
 酮基咪唑啉-1-基)甲基、六氫吡啶-1-基磺醯基、1,3-噻唑-2-
 基、1,3-噻唑-4-基、3,5-二甲基六氫吡啶-1-基、4-(第三丁
 氧基羰基)六氫吡啶-1-基、乙醯基(環己基)胺基、2-呋喃甲
 醯基胺基-3-甲基-5-酮基-2,5-二氫-1H-吡唑-1-基、四氫呋喃
 -2-基、呋喃-2-基、5-甲基-1,1-二氧基-1,2,5-噻二唑啉-2-基、
 (2,2-二甲基丙醯基)(甲基)胺基、(苄基胺磺醯基)甲基、(二
 甲基胺磺醯基)甲基、(呋喃-2-基羰基)胺基、[(1-苯基乙基)
 胺磺醯基]甲基、[乙基(甲基)胺磺醯基]甲基、[甲基(丙-2-
 基)胺磺醯基]甲基、5-酮基-3-(丙-2-基)-4,5-二氫-1H-吡唑-1-
 基、5-酮基-3-(三氟甲基)-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、(環丙基
 羰基)胺基、3-(1-甲基乙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、3-(2-甲基
 丙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、2-酮基-3-丙-2-烯-1-基咪唑啉-1-

基、3-第三丁基-2-酮基咪唑啉-1-基、吡咯啉-1-基磺醯基、2,5-二酮基咪唑啉-4-基、(嗎福啉-4-基磺醯基)甲基、(六氫吡啶-1-基磺醯基)甲基、(吡咯啉-1-基磺醯基)甲基、2-酮基咪唑啉-1-基、3,3-二甲基-2-酮基環戊基、3-酮基-4,5-二甲基-2,4-二氫吡啶-2-基、3,5-二酮基-4-乙基吡啶啉-1-基、5-酮基-4,5-二氫-1H-咪唑啉-1-基、1,1-二氧基-1,2-噻吡啉-2-基、6-甲基-1,1-二氧基-1,2,6-噻二吡啉-2-基、環丙基(三氟乙醯基)胺基,

而且, 如果 R^3 及 R^4 , 如果適當時經由 R^{12} 或 R^{13} 形成環, 下面通式(I)的次單元:



可代表(2-酮基-2,3-二氫-1H-吡啶-5-基)胺基、1H-吡啶-6-基胺基、1H-吡啶-5-基胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噻吡啉-6-基)胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噻吡啉-7-基)胺基、(1-乙醯基-2,3-二氫-1H-吡啶-6-基)胺基、(1-乙醯基-2,3-二氫-1H-吡啶-5-基)胺基、(2-酮基-2,3,4,5-四氫-1H-1-苯並吡啶-8-基)胺基、1,3-苯並二噻茂-5-基胺基、(2-酮基-1,3-苯並噻吡啉-5-基)胺基、(2-酮基-1,2,3,4-四氫喹啉-6-基)胺基、(3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噻吡啉-6-基)胺基、(2-酮基-2,3-二氫-1,3-苯並噻吡啉-6-基)胺基、(2-甲基-1,3-苯並噻吡啉-5-基)胺基、(2,2,3,3-四氟-2,3-二氫-1,4-苯並二氧芑

-6-基)胺基、(3-酮基-1,3-二氫-2-苯並呋喃-5-基)胺基、1-酮基-2,3-二氫-1H-茚-5-基)胺基,

R^6 代表氫、Me、甲醯基或 COMe,

R^7 代表氫,

R^8 代表氯、溴、 CF_3 、Me、氰基、碘或 CFH_2 ,

R^9 代表氫、甲基、乙基、丙-1-基、 CH_2CH_2OMe 或 $CH_2CH=CH_2$,

R^{10} 代表甲基、乙基、丙基、丙-2-基、丁基、丁-2-基、2-甲基丙基、第三丁基、戊基、3-甲基丁基、2-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、戊-2-基、戊-3-基、4-甲基戊-2-基、己-3-基、3,3-二甲基丁-2-基、2,4-二甲基戊-3-基、環戊基、2-甲基環戊基、2-乙基環戊基、2-氯環戊基、2-氟環戊基、2-氰基環戊基、2-甲氧基環戊基、2-(甲氧基甲基)環戊基、環己基、2-甲氧基環己基、2-甲基環己基、4,4-二氟環己基、4-(三氟甲基)環己基、丙-2-烯-1-基、2-甲基丙-2-烯-1-基、1-甲基丙-2-烯-1-基、3-甲基丁-2-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、4,4,4-三氟丁-2-烯-1-基、3-氯丁-2-烯-1-基、2-氯丙-2-烯-1-基、氰基甲基、2-氰基乙基、1-氰基丙-2-基、3-氰基丁-2-基、(三甲基矽烷基)甲基、1-(三甲基矽烷基)乙基、2-羥基乙基、2-甲氧基乙基、2-乙氧基乙基、2-(三氟甲氧基)乙基、1-羥基丙-2-基、1-羥基丁-2-基、3-羥基-3-甲基丁-2-基、2-羥基-2-甲基丙基、3-甲氧基-3-甲基丁-2-基、2-甲氧基-2-甲基丙基、1-甲氧基丙-2-基、1-乙氧基丙-2-基、1-三氟甲氧基丙-2-基、1-甲氧基丁-2-基、3-甲氧基丁-2-基、1-甲氧基-3-甲基丁-2-

基、1-甲氧基戊-2-基、2-(甲基胺磺醯基)乙基、(2R)-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基、(2S)-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基、2-甲基-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基，
及其農藝化學活性鹽類。

還特別較宜使用其中一或多個符號具有其中一個下面意義之式(I)化合物作為殺真菌劑：

X^1 代表 CR^3 ，

X^2 代表氮或 CR^4 ，

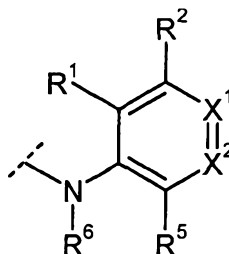
R^1 及 R^5 彼此獨立地代表氫、甲基、甲氧基或 F，

R^2 代表氫、氟、氯、溴、氰基、甲基、 CF_3 、羥基、OMe、OEt、 OCF_3 、COMe、SMe、 CO_2CH_3 、 CO_2Et 、NHMe、 NMe_2 、NEt、 NEt_2 或 $NHCOMe$ ，

R^3 及 R^4 彼此獨立地代表氫、氟、氯、溴、氰基、羥基、OMe、OEt、OPr、O*iso*Pr、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 OCF_2CF_2H 、 $CONHMe$ 、 $CONHEt$ 、 $CONHisoPr$ 、 $CONMe_2$ 、 SF_5 、SMe、SEt、SPr、SiPr、 SCF_3 、 SCF_2H 、 SO_2Me 、 SO_2CF_3 、 SO_2NMe_2 、甲醯基、COMe、COEt、 $COCF_3$ 、 $COCH_2CN$ 、 $CONHMe$ 、 $CONMe_2$ 、 $CONHEt$ 、 $CONEt_2$ 、 $CONHPr$ 、 $CONHisoPr$ 、 $CONHBu$ 、 $CONHtertBu$ 、 $CONHCH_2CH=CH_2$ 、

$CONHCH_2C\equiv CH$ 、 $CONHPh$ 、 $CONH$ -環丙基、六氫吡啶-1-基羰基、嗎福啉-4-基羰基、 CO_2CH_3 、 CO_2Et 、 CO_2Pr 、 CO_2isoPr 、 $CO_2(CH_2)_2OCH_3$ 、 $NHCOMe$ 、 $NHCOEt$ 、 $NHCOPr$ 、 $NHCOisoPr$ 、 $NHCOCF_3$ 、 $NHCOtertBu$ 、 $N(C_2H_5)COMe$ 、 $NHCOCH=CH_2$ 、 $NHCOPh$ 、 $NHCOC(CH_3)_2CH_2F$ 、

$\text{NHCO}(\text{C}=\text{CH}_2)\text{CH}_3$ 、 $\text{N}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$ 、 NHCHO 、 NMeCHO 、
 NHCO_2Me 、 NHCO_2Et 、 NHCO_2Ph 、 NHMe 、 NMe_2 、 NHEt 、
 NEt_2 、 NHPr 、 NHisoPr 、環丙基胺基、乙醯基(環丙基)胺基、
 $[(1\text{-甲基環丙基})\text{羰基}]\text{胺基}$ 、嗎福啉-1-基、 CH_2CN 、
 CHMeCN 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NHMe}$ 、 $\text{CH}_2\text{SO}_2\text{NHPr}$ 、 CH_2COCH_3 、
 $\text{CH}_2\text{COtertBu}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Et}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2\text{Me}$ 、 CH_2NHAc 、甲基、
 乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、
 1,1-二甲基乙基、丙-2-烯-1-基、 CF_3 、 CF_2H 、嗎福啉-4-基
 磺醯基、3-甲基-2,5-二酮基咪唑啉-1-基、3-甲基-2-酮基咪
 唑啉-1-基、(3-甲基-2-酮基咪唑啉-1-基)甲基、六氫吡啶-1-
 基磺醯基、1,3-噻唑-2-基、1,3-噻唑-4-基、3,5-二甲基六氫
 吡啶-1-基、4-(第三丁氧基羰基)六氫吡啶-1-基、乙醯基(環
 己基)胺基、2-呋喃甲醯基胺基、3-甲基-5-酮基-2,5-二氫-1H-
 吡唑-1-基、四氫呋喃-2-基、呋喃-2-基、5-甲基-1,1-二氧基
 -1,2,5-噻二唑啉-2-基、(2,2-二甲基丙醯基)(甲基)胺基、(苄
 基胺磺醯基)甲基、(二甲基胺磺醯基)甲基、(呋喃-2-基羰基)
 胺基、[(1-苯基乙基)胺磺醯基]甲基、[乙基(甲基)胺磺醯基]
 甲基、[甲基(丙-2-基)胺磺醯基]甲基、5-酮基-3-(丙-2-
 基)-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、5-酮基-3-(三氟甲基)-4,5-二氫
 -1H-吡唑-1-基、環丙基(三氟乙醯基)胺基，
 而且，如果 R^3 及 R^4 ，如果適當時經由 R^{12} 或 R^{13} 形成環，
 下面通式(I)的次單元：



可代表(2-酮基-2,3-二氫-1H-吡啶-5-基)胺基、1H-吡啶-6-基胺基、1H-吡啶-5-基胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘧啶-6-基)胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘧啶-7-基)胺基、(1-乙醯基-2,3-二氫-1H-吡啶-6-基)胺基、(1-乙醯基-2,3-二氫-1H-吡啶-5-基)胺基、(2-酮基-2,3,4,5-四氫-1H-1-苯並吡啶-8-基)胺基、1,3-苯並二嘧啶-5-基胺基、(2-酮基-1,3-苯並嘧啶-5-基)胺基、(2-酮基-1,2,3,4-四氫喹啉-6-基)胺基、(3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘧啶-6-基)胺基、(2-酮基-2,3-二氫-1,3-苯並嘧啶-6-基)胺基、(2-甲基-1,3-苯並嘧啶-5-基)胺基、(2,2,3,3-四氫-2,3-二氫-1,4-苯並二氧芑-6-基)胺基、(3-酮基-1,3-二氫-2-苯並呋喃-5-基)胺基、1-酮基-2,3-二氫-1H-茚-5-基)胺基，

R^6 代表氫、Me、甲醯基或 COMe，

R^7 代表氫，

R^8 代表氯、溴、 CF_3 、氰基、碘或 CFH_2 ，

R^9 代表氫、甲基、乙基、丙-1-基或 $CH_2CH=CH_2$ ，

R^{10} 代表甲基、乙基、丙基、丙-2-基、丁基、丁-2-基、2-甲基丙基、第三丁基、戊基、3-甲基丁基、2-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、戊-2-基、戊-3-基、4-甲基戊-2-基、己-3-基、環戊基、2-甲基環戊基、2-乙基環戊基、2-(甲氧基甲基)環戊基、環己基、(3-三氟甲基)環己基、丙-2-烯-1-基、2-甲基丙-2-烯-1-基、3-甲基丁-2-烯-1-基、2-氯丙-2-烯-1-基、氰基甲基、2-氰基乙基、(三甲基矽烷基)甲基、1-(三甲基矽烷基)

基)乙基、2-羥基乙基、2-甲氧基乙基、2-乙氧基乙基、2-(三氟甲氧基)乙基、1-羥基丙-2-基、1-羥基丁-2-基、1-甲氧基丙-2-基、1-乙氧基丙-2-基、1-三氟甲氧基丙-2-基、1-甲氧基丁-2-基、3-甲氧基丁-2-基、1-甲氧基-3-甲基丁-2-基、1-甲氧基戊-2-基、2-(甲基胺磺醯基)乙基、(2R)-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基、(2S)-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基、2-甲基-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基，

及其農藝化學活性鹽類。

還特別較宜使用其中一或多個符號具有其中一個下面意義之式(I)化合物作為殺真菌劑：

X^1 代表 CR^3 ，

X^2 代表氮或 CR^4 ，

R^1 及 R^5 彼此獨立地代表氫或 F，

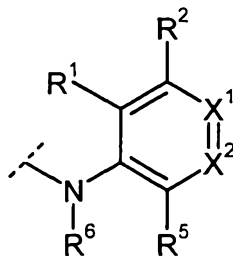
R^2 代表氫、氯或 OMe，

R^3 代表氫、氟、氯、氰基、羥基、OMe、OisoPr、OCF₃、OCF₂CF₂H、SMe、SCF₃、SCF₂H、SO₂Me、SO₂NMe₂、甲醯基、COMe、COEt、COCH₂CN、CONHMe、CONMe₂、CONHtertBu、CONHCH₂CH=CH₂、CONHPh、CONH-環丙基、CO₂CH₃、NHCOMe、NHCOisoPr、NHCOCF₃、NHCOtertBu、N(C₂H₅)COMe、N(CH₃)COCH₃、NHCHO、NHCO₂Me、NHCO₂Et、NEt₂、環丙基胺基、[(1-甲基環丙基)羰基]胺基、CH₂COCH₃、CH₂COtertBu、CH₂CO₂Me、甲基、乙基、1-甲基乙基、CF₃、嗎福啉-4-基磺醯基、3-甲基-2,5-二酮基咪唑啉-1-基、1,3-噻唑-4-基、4-(第三丁氧基羰

基)六氫吡啶-1-基、乙醯基(環己基)胺基、(2,2-二甲基丙醯基)(甲基)胺基或環丙基(三氟乙醯基)胺基,

R^4 代表氫、氟、氯、氰基、羥基、OMe、OEt、OCF₃、OCF₂CF₂H、OCONHMe、SMe、SO₂NMe₂、甲醯基、COMe、COEt、COCH₂CN、CONHMe、CONMe₂、CONH*tert*Bu、NHCOMe、NHCO*iso*Pr、NHCO*tert*Bu、NHCOC(CH₃)₂CH₂F、NHCO(C=CH₂)CH₃、N(CH₃)COCH₃、NHCHO、NHCO₂Me、NHCO₂Et、NHCO₂Ph、[(1-甲基環丙基)羰基]胺基、CH₂CN、CH₂COCH₃、CH₂CO*tert*Bu、CH₂CO₂Me、甲基、乙基、1-甲基乙基、CF₃、嗎福啉-4-基磺醯基、(3-甲基-2-酮基咪唑啉-1-基)甲基、六氫吡啶-1-基磺醯基、(苄基胺磺醯基)甲基、(二甲基胺磺醯基)甲基、(呋喃-2-基羰基)胺基、[(1-苯基乙基)胺磺醯基]甲基、[乙基(甲基)胺磺醯基]甲基或[甲基(丙-2-基)胺磺醯基]甲基,

而且, 如果 R^3 及 R^4 , 如果適當時經由 R^{12} 或 R^{13} 形成環, 下面通式(I)的次單元:



可以是 1H-吡啶-6-基胺基、1H-吡啶-5-基胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘧啶-6-基)胺基、(1-乙醯基-2,3-二氫-1H-吡啶-6-基)胺基、(1-乙醯基-2,3-二氫-1H-吡啶-5-基)胺基、(2-酮基-2,3,4,5-四氫-1H-1-苯並吡啶-8-基)胺

基、1,3-苯並二𫏓茂-5-基胺基、(2-酮基-1,3-苯並𫏓𫏓-5-基)胺基、(2-酮基-1,2,3,4-四氫𫏓𫏓-6-基)胺基、(2-酮基-2,3-二氫-1,3-苯並𫏓𫏓-6-基)胺基、(2-甲基-1,3-苯並𫏓𫏓-5-基)胺基、(2,2,3,3-四氟-2,3-二氫-1,4-苯並二氧𫏓-6-基)胺基、(3-酮基-1,3-二氫-2-苯並𫏓𫏓-5-基)胺基或 1-酮基-2,3-二氫-1H-𫏓-5-基)胺基,

R^6 代表氫,

R^7 代表氫,

R^8 代表氯、溴、 CF_3 或氰基,

R^9 代表氫、甲基或乙基,

R^{10} 代表甲基、乙基、丙基、丙-2-基、丁基、丁-2-基、第三丁基、4-甲基戊-2-基、己-3-基、環戊基、環己基、丙-2-烯-1-基、氰基甲基、2-羥基乙基、2-甲氧基乙基、2-乙氧基乙基、2-(三氟甲氧基)乙基、1-羥基丙-2-基、1-羥基丁-2-基、1-甲氧基丙-2-基、1-甲氧基丁-2-基、1-甲氧基-3-甲基丁-2-基、1-甲氧基戊-2-基、2-(甲基胺磺醯基)乙基、(2R)-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基、(2S)-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基或 2-甲基-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基, 及其農藝化學活性鹽類。

還較宜使用其中一或多個符號具有其中一個下面意義之式(I)化合物作為殺真菌劑:

X^1 代表 CR^3 ,

X^2 代表 CR^4 ,

R^3 代表氫、氟、氯、氰基、羥基、OMe、OisoPr、 OCF_3 、

OCF₂CF₂H、SMe、SCF₃、SCF₂H、SO₂Me、SO₂NMe₂、甲
 醯基、COMe、COEt、COCH₂CN、CONHMe、CONMe₂、
 CONH*tert*Bu、CONHCH₂CH=CH₂、CONHPh、CONH-環丙
 基、CO₂CH₃、NHCOMe、NHCO*iso*Pr、NHCOCF₃、
 NHCOT*tert*Bu、N(C₂H₅)COMe、N(CH₃)COCH₃、NHCHO、
 NHCO₂Me、NHCO₂Et、NEt₂、環丙基胺基、[(1-甲基環丙
 基)羰基]胺基、CH₂COCH₃、CH₂COT*tert*Bu、CH₂CO₂Me、甲
 基、乙基、1-甲基乙基、CF₃、嗎福啉-4-基磺醯基、3-甲基
 -2,5-二酮基咪唑啉-1-基、1,3-噻唑-4-基、4-(第三丁氧基羰
 基)六氫吡啶-1-基、乙醯基(環己基)胺基、(2,2-二甲基丙醯
 基)(甲基)胺基或環丙基(三氟乙醯基)胺基，
 其中其他取代基具有一或多個上述之意義，
 及其農藝化學活性鹽類。

還較宜使用其中一或多個符號具有其中一個下面意義
 之式(I)化合物作為殺真菌劑：

X¹ 代表 CR³，

X² 代表氮或 CR⁴，

R⁴ 代表氫、氟、氯、氰基、羥基、OMe、OEt、OCF₃、OCF₂CF₂H、
 OCONHMe、SMe、SO₂NMe₂、甲醯基、COMe、COEt、
 COCH₂CN、CONHMe、CONMe₂、CONH*tert*Bu、NHCOMe、
 NHCO*iso*Pr、NHCOT*tert*Bu、NHCOC(CH₃)₂CH₂F、
 NHCO(C=CH₂)CH₃、N(CH₃)COCH₃、NHCHO、NHCO₂Me、
 NHCO₂Et、NHCO₂Ph、[(1-甲基環丙基)羰基]胺基、CH₂CN、
 CH₂COCH₃、CH₂COT*tert*Bu、CH₂CO₂Me、甲基、乙基、1-

甲基乙基、 CF_3 、嗎福啉-4-基磺醯基、(3-甲基-2-酮基咪唑啉-1-基)甲基、六氫吡啶-1-基磺醯基、(苄基胺磺醯基)甲基、(二甲基胺磺醯基)甲基、(呋喃-2-基羰基)胺基、[(1-苯基乙基)胺磺醯基]甲基、[乙基(甲基)胺磺醯基]甲基或[甲基(丙-2-基)胺磺醯基]甲基，

其中其他取代基具有一或多個上述之意義，
及其農藝化學活性鹽類。

還較宜使用其中一或多個符號具有其中一個下面意義之式(I)化合物作為殺真菌劑：

R^6 代表 H、CHO 或 COCH_3 ，

R^7 代表 H，

R^9 代表 H、Me 或乙基，

其中其他取代基具有一或多個上述之意義，
及其農藝化學活性鹽類。

還較宜使用其中一或多個符號具有其中一個下面意義之式(I)化合物作為殺真菌劑：

R^1 代表氫或氟，

R^5 代表氫或氟，

其中其他取代基具有一或多個上述之意義，
及其農藝化學活性鹽類。

還較宜使用式(I)化合物作為殺真菌劑，其中：

R^6 代表氫，

其中其他取代基具有一或多個上述之意義，
及其農藝化學活性鹽類。

還較宜使用其中一或多個符號具有其中一個下面意義之式(I)化合物作為殺真菌劑：

R^1 代表氫或氟，

R^5 代表氫或氟，

X^1 代表 CR^3 且

X^2 代表 CR^4 ，

其中其他取代基具有一或多個上述之意義，
及其農藝化學活性鹽類。

還較宜使用式(I)化合物作為殺真菌劑，其中：

R^7 代表氫，

其中其他取代基具有一或多個上述之意義，
及其農藝化學活性鹽類。

還較宜使用式(I)化合物作為殺真菌劑，其中：

R^8 代表氯、溴、 CF_3 或氰基，

其中其他取代基具有一或多個上述之意義，
及其農藝化學活性鹽類。

還較宜使用式(I)化合物作為殺真菌劑，其中：

R^9 代表氫、Me 或乙基，

其中其他取代基具有一或多個上述之意義，
及其農藝化學活性鹽類。

還較宜使用式(I)化合物作為殺真菌劑，其中：

R^{10} 代表甲基、乙基、丙基、丙-2-基、丁基、丁-2-基、第三丁基、4-甲基戊-2-基、己-3-基、環戊基、環己基、丙-2-烯-1-基、氰基甲基、2-羥基乙基、2-甲氧基乙基、2-乙氧基

乙基、2-(三氟甲氧基)乙基、1-羥基丙-2-基、1-羥基丁-2-基、1-甲氧基丙-2-基、1-甲氧基丁-2-基、1-甲氧基-3-甲基丁-2-基、1-甲氧基戊-2-基、2-(甲基胺磺醯基)乙基、(2R)-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基、(2S)-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基或 2-甲基-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基，其中其他取代基具有一或多個上述之意義，及其農藝化學活性鹽類。

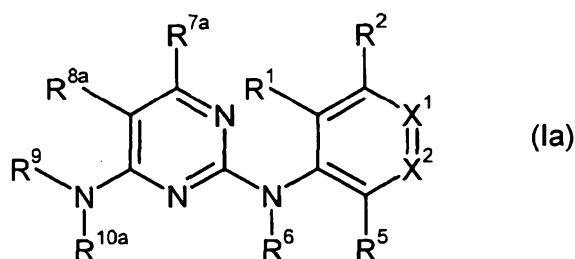
還較宜使用式(I)化合物作為殺真菌劑，其中：
 R^1 、 R^5 、 R^6 及 R^7 代表氫，
 其中其他取代基具有一或多個上述之意義，
 及其農藝化學活性鹽類。

上述基團定義需要時可以彼此結合。而且，個別的定義可以不適用。

本發明也提供通式(Ia)、(Ib)及(Ic)之化合物。

根據本發明之式(Ia)、(Ib)及(Ic)之化合物及其農藝化學活性鹽類非常合適作為殺蟲劑使用，且特別是用於控制植物病源有害的真菌。根據本發明上述之化合物具有特別強的殺真菌活性且可以同時用在農作物保護、家庭及衛生領域以及物質之保護。

式(Ia)之化合物，



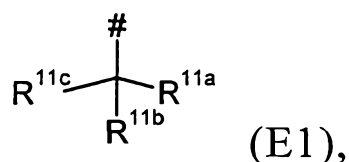
其中

X^1 、 X^2 、 R^1 至 R^6 、 R^9 、 R^{12} 及 R^{13} 具有上述的一般、較佳、特別較佳、非常特別較佳及尤其較佳的意義，

R^{7a} 代表氫、 C_2 - C_3 -烷基、氰基或 C_1 - C_3 -鹵烷基，

R^{8a} 代表氯、碘、SMe、SOMe、 SO_2 Me、 CCl_3 、 CFH_2 或 CF_2H ，

R^{10a} 代表下式之 E1 基團



其中符號定義如下且 # 代表連接至氮原子的點：

R^{11a} 代表氫或甲基，

R^{11b} 代表氫或 C_1 - C_3 -烷基，

R^{11c} 代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、CN、 CH_2 CN、 $CH(Me)$ CN、

$C(Me)_2$ CN、 CH_2O -(C_1 - C_3 -烷基)、 CH_2O -(C_1 - C_3 -鹵烷基)、

$C(Me)_2OH$ 、 $C(Me)HO$ -(C_1 - C_3 -烷基)、 $C(Me)_2O$ -(C_1 - C_3 -烷基)、

$C(Me)HO$ -(C_1 - C_3 -鹵烷基)、 $C(Me)_2O$ -(C_1 - C_3 -鹵烷基)、

CH_2S -(C_1 - C_3 -烷基)、 $C(Me)HS$ -(C_1 - C_3 -烷基)、

$C(Me)_2S$ -(C_1 - C_3 -烷基)、 Si -(C_1 - C_2 -烷基) $_3$ 或 C_2 - C_4 -烯基其隨

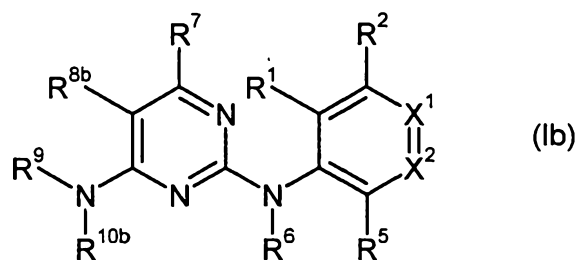
意地經鹵基或 CF_3 取代，

或

R^{11c} 代表環戊基或環己基環其隨意地經CN、鹵基、 C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_3 -烷氧基、 C_1 - C_3 -鹵烷基、 C_1 - C_3 -鹵烷氧基、 C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基取代，

及這些化合物之農藝化學活性鹽類。

式(Ib)之化合物，

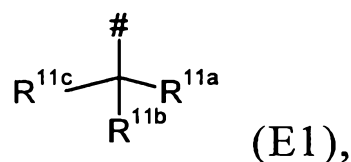


其中

X^1 、 X^2 、 R^1 至 R^7 、 R^9 、 R^{12} 及 R^{13} 具有上述的一般、較佳、特別較佳、非常特別較佳及尤其較佳的意義，

R^{8b} 代表 CF_3 ，

R^{10b} 代表下式之 E1 基團



其中符號定義如下且 # 代表連接至氮原子的點：

R^{11a} 代表氫或甲基，

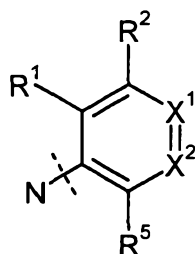
R^{11b} 代表氫或 C_1 - C_3 -烷基，

R^{11c} 代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、CN、 CH_2CN 、 $CH(Me)CN$ 、 $C(Me)_2CN$ 、 $CH_2O-(C_1-C_3-烷基)$ 、 $CH_2O-(C_1-C_3-鹵烷基)$ 、 $C(Me)_2OH$ 、 $C(Me)HO-(C_1-C_3-烷基)$ 、 $C(Me)_2O-(C_1-C_3-烷基)$ 、 $C(Me)HO-(C_1-C_3-鹵烷基)$ 、 $C(Me)_2O-(C_1-C_3-鹵烷基)$ 、 $CH_2S-(C_1-C_3-烷基)$ 、 $C(Me)HS-(C_1-C_3-烷基)$ 、 $C(Me)_2S-(C_1-C_3-烷基)$ 、 $Si-(C_1-C_2-烷基)_3$ 或 C_2 - C_4 -烯基其隨意地經鹵基或 CF_3 取代，

或

R^{1c} 代表環戊基或環己基環其隨意地經 CN、鹵基、 C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_3 -烷氧基、 C_1 - C_3 -鹵烷基、 C_1 - C_3 -鹵烷氧基、 C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基取代；

不包括其中在下面通式(Ib)之次單元中



X^1 代表 CR^3 且 X^2 代表 CR^4 且

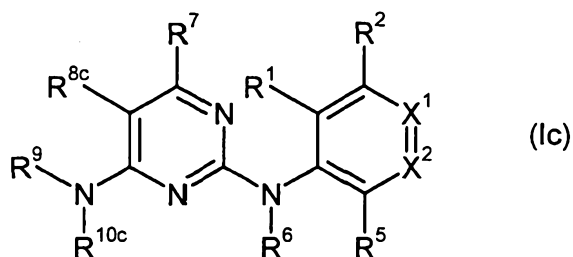
R^3 及 R^4 一起與苯基環形成 1*H*-2-羥基吡啶-5-基或 1*H*-2-羥基吡啶-6-基；

或 R^3 代表 $CON(R^{12})_2$ 且另兩個 R^{12} 一起與和其連結之氮原子形成 4-甲基-1,4-六氫吡嗪基；

或 R^2 及 R^3 或 R^3 及 R^4 代表氯；

及這些化合物之農藝化學活性鹽類。

式(Ic)之化合物，

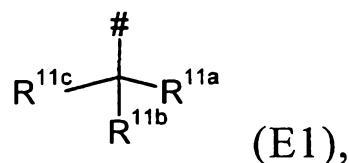


其中

X^1 、 X^2 、 R^1 至 R^7 、 R^9 、 R^{12} 及 R^{13} 具有上述的一般、較佳、特別較佳、非常特別較佳及尤其較佳的意義，

R^{8c} 代表溴且

R^{10c} 代表下式之 E1 基團



其中符號定義如下且 # 代表連接至氮原子的點：

R^{11a} 代表氫或甲基，

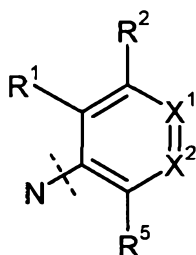
R^{11b} 代表氫或 C_1 - C_3 -烷基，

R^{11c} 代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、CN、 CH_2CN 、 $CH(Me)CN$ 、 $C(Me)_2CN$ 、 $CH_2O-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $CH_2O-(C_1-C_3\text{-鹵烷基})$ 、 $C(Me)_2OH$ 、 $C(Me)HO-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $C(Me)_2O-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $C(Me)HO-(C_1-C_3\text{-鹵烷基})$ 、 $C(Me)_2O-(C_1-C_3\text{-鹵烷基})$ 、 $CH_2S-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $C(Me)HS-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $C(Me)_2S-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $Si-(C_1-C_2\text{-烷基})_3$ 或 C_2 - C_4 -烯基其隨意地經鹵基或 CF_3 取代，

或

R^{11c} 代表環戊基或環己基環其隨意地經 CN、鹵基、 C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_3 -烷氧基、 C_1 - C_3 -鹵烷基、 C_1 - C_3 -鹵烷氧基、 C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基取代；

不包括其中在下面通式 (Ic) 之次單元中



X^1 代表 CR^3 且 X^2 代表 CR^4 且

R^3 及 R^4 一起與苯基環形成 *1H*-2-羥基吡啶-5-基或 *1H*-吡啶-5-基胺基；

或 R^3 代表 H、SMe、SOMe、SO₂NMe₂、六氫吡啶-1-基、4-第三丁氧基羰基六氫吡啶-1-基或(吡咯啉-1-基)甲基；

或 R^2 或 R^4 代表 SMe；

及這些化合物之農藝化學活性鹽類。

上述基團定義需要時可以彼此結合。而且，個別的定義可以不適用。

式(I)、(Ia)、(Ib)及(Ic)之化合物可以同時存在為純的形式或作為多種可能的異構物形式之混合物，特別是立體異構物，例如 E 及 Z、蘇-及赤-、以及光學異構物，例如 R 及 S 異構物，或阻轉異構物，及如果適當時的互變異構物。申請專利的是 E 及 Z 異構物、蘇-及赤-、及光學異構物、這些異構物之任何混合物，以及可能的互變異構物形式。

取決於上面定義的取代基之本質，式(I)、(Ia)、(Ib)及(Ic)之化合物具有酸性或鹼性性質且可以與無機或有機酸或鹼或金屬離子形成鹽，如果適當時也可形成內鹽或加成物。如果式(I)、(Ia)、(Ib)及(Ic)之化合物帶有胺基、烷基胺基或引發鹼性性質之其他基團時，這些化合物可以與酸反應而得到鹽類，或其在合成時直接得到為鹽類。如果式(I)、(Ia)、(Ib)及(Ic)之化合物帶有羥基、羧基或引發酸性性質之其他基團時，這些化合物可以與鹼反應而得到鹽類。合適的鹼是例如鹼金屬及鹼土金屬特別是鈉、鉀、鎂及鈣之氫氧化物、碳酸鹽、碳酸氫鹽，以及氨、含有(C₁-C₄)-

烷基之一級、二級及三級胺， (C_1-C_4) -烷醇之單-、二-及三烷醇胺，膽鹼及氯膽鹼。

在此方式中所得的鹽類也具有殺真菌的性質。

無機酸之實例是氫鹵酸類，例如氫氟酸、氫氯酸、氫溴酸及氫碘酸，硫酸、磷酸及硝酸，以及酸性鹽類例如 $NaHSO_4$ 及 $KHSO_4$ 。合適的有機酸是例如甲酸、碳酸及烷酸，例如乙酸、三氟乙酸、三氯乙酸及丙酸，以及乙醇酸、硫氰酸、乳酸、琥珀酸、檸檬酸、苯甲酸、肉桂酸、草酸、烷基磺酸(含有 1 至 20 個碳原子的直鏈或支鏈烷基之磺酸)、芳基磺酸或芳基二磺酸(芳基例如苯基及萘基，其帶有一或兩個磺酸基)、烷基膦酸(含有 1 至 20 個碳原子的直鏈或支鏈烷基之膦酸)、芳基膦酸或芳基二膦酸(芳基例如苯基及萘基，其帶有一或兩個磺酸基)，其中烷基及芳基可帶有其他取代基，例如對-甲苯磺酸、水楊酸、對-胺基水楊酸、2-苯氧基苯甲酸、2-乙醯氧基苯甲酸等。

合適的金屬離子特別是第二主族特別是鈣及鎂、第三及第四主族特別是鋁、錫及鉛以及第一至第八過渡族特別是鉻、錳、鐵、鈷、鎳、銅、鋅及其他元素之離子。特別較宜是第四週期元素之金屬離子。在此，金屬可以存在其可想得到的多種價數。

隨意地經取代之基團可以是單-或多取代，其中在多取代之情形下，取代基可以相同或不同。

在上式中提供的符號之定義中，使用集合性詞語其廣泛地代表下面的取代基：

鹵基：氟、氯、溴及碘；

芳基：未經取代或隨意地經取代之 5-至 15-員部份或完全未飽和的單-、二-或三環的環系統其含有至多 3 個選自 C(=O)、(C=S)之環成員，其中環系統之至少一個環是完全未飽和，例如(但不限於此)苯、萘、四氫萘、蒽、氫茚、菲、蒽；

烷基：含有 1 至 10 個碳原子之飽和直鏈或或支鏈烴基，例如(但不限於此)甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基-丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、戊基、1-甲基丁基、2-甲基丁基、3-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、1-乙基丙基、己基、1,1-二甲基丙基、1,2-二甲基丙基、1-甲基戊基、2-甲基戊基、3-甲基戊基、4-甲基戊基、1-二甲基丁基、1,2-二甲基丁基、1,3-二甲基丁基、2,2-二甲基丁基、2,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、1-乙基丁基、2-乙基丁基、1,1,2-三甲基丙基、1,2,2-三甲基丙基、1-乙基-1-甲基丙基及 1-乙基-2-甲基丙基、庚基、1-甲基己基、辛基、1,1-二甲基己基、2-乙基己基、1-乙基己基、壬基、1,2,2-三甲基己基、癸基；

鹵烷基：含有 1 至 4 個碳原子之直鏈或或支鏈烷基(如上述)，其中在這些基團的部份或全部的氫原子可以被上述鹵素原子取代，例如(但不限於此)C₁-C₂-鹵烷基例如氟甲基、溴甲基、二氟甲基、三氟甲基、氯甲基、二氯甲基、三氯甲基、氯氯甲基、二氯氯甲基、氯二氯甲基、1-氯乙基、1-溴乙基、1-氟乙基、2-氟乙基、2,2-二氟乙基、2,2,2-

三氟乙基、2-氯-2-氟乙基、2-氯-2-二氟乙基、2,2-二氯-2-氟乙基、2,2,2-三氯乙基、五氟乙基及 1,1,1-三氟丙-2-基；

烯基：含有 2 至 16 個碳原子且在任何位置含有至少一個雙鍵之不飽和的直鏈或支鏈烴基，例如(但不限於此) C_2-C_6 -烯基例如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基、1-甲基乙烯基、1-丁烯基、2-丁烯基、3-丁烯基、1-甲基-1-丙烯基、2-甲基-1-丙烯基、1-甲基-2-丙烯基、2-甲基-2-丙烯基、1-戊烯基、2-戊烯基、3-戊烯基、4-戊烯基、1-甲基-1-丁烯基、2-甲基-1-丁烯基、3-甲基-1-丁烯基、1-甲基-2-丁烯基、2-甲基-2-丁烯基、3-甲基-2-丁烯基、1-甲基-3-丁烯基、2-甲基-3-丁烯基、3-甲基-3-丁烯基、1,1-二甲基-2-丙烯基、1,2-二甲基-1-丙烯基、1,2-二甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-丙烯基、1-乙基-2-丙烯基、1-己烯基、2-己烯基、3-己烯基、4-己烯基、5-己烯基、1-甲基-1-戊烯基、2-甲基-1-戊烯基、3-甲基-1-戊烯基、4-甲基-1-戊烯基、1-甲基-2-戊烯基、2-甲基-2-戊烯基、3-甲基-2-戊烯基、4-甲基-2-戊烯基、1-甲基-3-戊烯基、2-甲基-3-戊烯基、3-甲基-3-戊烯基、4-甲基-3-戊烯基、1-甲基-4-戊烯基、2-甲基-4-戊烯基、3-甲基-4-戊烯基、4-甲基-4-戊烯基、1,1-二甲基-2-丁烯基、1,1-二甲基-3-丁烯基、1,2-二甲基-1-丁烯基、1,2-二甲基-2-丁烯基、1,2-二甲基-3-丁烯基、1,3-二甲基-1-丁烯基、1,3-二甲基-2-丁烯基、1,3-二甲基-3-丁烯基、2,2-二甲基-3-丁烯基、2,3-二甲基-1-丁烯基、2,3-二甲基-2-丁烯基、2,3-二甲基-3-丁烯基、3,3-二甲基-1-丁烯基、3,3-二甲基-2-丁烯基、1-乙基-1-丁烯基、

1-乙基-2-丁烯基、1-乙基-3-丁烯基、2-乙基-1-丁烯基、2-乙基-2-丁烯基、2-乙基-3-丁烯基、1,1,2-三甲基-2-丙烯基、1-乙基-1-甲基-2-丙烯基、1-乙基-2-甲基-1-丙烯基及 1-乙基-2-甲基-2-丙烯基；

炔基：含有 2 至 16 個碳原子且在任何位置含有至少一個參鍵之直鏈或支鏈烴基，例如(但不限於此) C_2 - C_6 -炔基例如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基、1-丁炔基、2-丁炔基、3-丁炔基、1-甲基-2-丙炔基、1-戊炔基、2-戊炔基、3-戊炔基、4-戊炔基、1-甲基-2-丁炔基、1-甲基-3-丁炔基、2-甲基-3-丁炔基、3-甲基-1-丁炔基、1,1-二甲基-2-丙炔基、1-乙基-2-丙炔基、1-己炔基、2-己炔基、3-己炔基、4-己炔基、5-己炔基、1-甲基-2-戊炔基、1-甲基-3-戊炔基、1-甲基-4-戊炔基、2-甲基-3-戊炔基、2-甲基-4-戊炔基、3-甲基-1-戊炔基、3-甲基-4-戊炔基、4-甲基-1-戊炔基、4-甲基-2-戊炔基、1,1-二甲基-2-丁炔基、1,1-二甲基-3-丁炔基、1,2-二甲基-3-丁炔基、2,2-二甲基-3-丁炔基、3,3-二甲基-1-丁炔基、1-乙基-2-丁炔基、1-乙基-3-丁炔基、2-乙基-3-丁炔基及 1-乙基-1-甲基-2-丙炔基；

烷氧基：含有 1 至 4 個碳原子之飽和直鏈或支鏈的烷氧基，例如(但不限於此) C_1 - C_4 -烷氧基例如甲氧基、乙氧基、丙氧基、1-甲基乙氧基、丁氧基、1-甲基丙氧基、2-甲基丙氧基、1,1-二甲基乙氧基；

鹵烷氧基：含有 1 至 4 個碳原子之直鏈或支鏈的烷氧基(如上述)，其中在這些基團中的部份或全部氫原子可經上

述鹵素原子取代，例如(但不限於此) C_1 - C_2 -鹵烷氧基例如氯甲氧基、溴甲氧基、二氯甲氧基、三氯甲氧基、氟甲氧基、二氟甲氧基、三氟甲氧基、氯氟甲氧基、二氯氟甲氧基、氯二氟甲氧基、1-氯乙氧基、1-溴乙氧基、1-氟乙氧基、2-氟乙氧基、2,2-二氟乙氧基、2,2,2-三氟乙氧基、2-氯-2-氟乙氧基、2-氯-2,2-二氟乙氧基、2,2-二氯-2-氟乙氧基、2,2,2-三氯乙氧基、五氟乙氧基及 1,1,1-三氟丙-2-氧基；

硫烷基：含有 1 至 6 個碳原子之飽和直鏈或支鏈的烷硫基，例如(但不限於此) C_1 - C_6 -烷硫基例如，例如(但不限於此)甲硫基、乙硫基、丙硫基、1-甲基乙硫基、丁硫基、1-甲基丙硫基、2-甲基丙硫基、1,1-二甲基乙硫基、戊硫基、1-甲基丁硫基、2-甲基丁硫基、3-甲基丁硫基、2,2-二甲基丙硫基、1-乙基丙硫基、己硫基、1,1-二甲基丙硫基、1,2-二甲基丙硫基、1-甲基戊硫基、2-甲基戊硫基、3-甲基戊硫基、4-甲基戊硫基、1,1-二甲基丁硫基、1,2-二甲基丁硫基、1,3-二甲基丁硫基、2,2-二甲基丁硫基、2,3-二甲基丁硫基、3,3-二甲基丁硫基、1-乙基丁硫基、2-乙基丁硫基、1,1,2-三甲基丙硫基、1,2,2-三甲基丙硫基、1-乙基-1-甲基丙硫基及 1-乙基-2-甲基丙硫基；

硫鹵烷基：含有 1 至 6 個碳原子之直鏈或支鏈烷硫基(如上述)，其中在這些基團中的部份或全部氫原子可經上述鹵素原子取代，例如(但不限於此) C_1 - C_2 -鹵烷硫基例如氯甲硫基、溴甲硫基、二氯甲硫基、三氯甲硫基、氟甲硫基、二氟甲硫基、三氟甲硫基、氯氟甲硫基、二氯氟甲硫基、

氯二氟甲硫基、1-氯乙硫基、1-溴乙硫基、1-氟乙硫基、2-氟乙硫基、2,2-二氟乙硫基、2,2,2-三氟乙硫基、2-氯-2-氟乙硫基、2-氯-2,2-二氟乙硫基、2,2-二氯-2-氟乙硫基、2,2,2-三氯乙硫基、五氟乙硫基及 1,1,1-三氟丙-2-硫基；

環烷基：含有 3 至 12 個碳環成員之單-、二-或三環的飽和烴基，例如(但不限於此)環丙基、環丁基、環戊基及環己基、二環[1,0,1]丁烷、莰烷基、降冰片基；

環烯基：含有 5 至 15 個碳環成員及至少一個雙鍵之單-、二-或三環的非芳族烴基，例如(但不限於此)環戊烯-1-基、環己烯-1-基、環庚-1,3-二烯-1-基、降冰片烯-1-基；

(烷氧基)羰基：經由羰基(-CO-)連接至主鏈的含有 1 至 4 個碳原子之烷氧基；

雜環基：3-至 15-員飽和或部份不飽和的雜環其含有 1 至 4 個從包括氧、氮及硫的雜原子：除了碳環成員之外，含有 1 至 3 個氮原子及/或 1 個氧或硫原子或 1 或 2 個氧及/或硫原子之單-、二-或三環的雜環；如果此環含有多個氧原子，這些氧原子不直接相鄰；例如(但不限於此)環氧乙烷基、吡啶基、2-四氫呋喃基、3-四氫呋喃基、2-四氫噻吩基、3-四氫噻吩基、2-吡咯啉基、3-吡咯啉基、3-異噁唑啉基、4-異噁唑啉基、5-異噁唑啉基、3-異噻唑啉基、4-異噻唑啉基、5-異噻唑啉基、3-吡唑啉基、4-吡唑啉基、5-吡唑啉基、2-噁唑啉基、4-噁唑啉基、5-噁唑啉基、2-噻唑啉基、4-噻唑啉基、5-噻唑啉基、2-咪唑啉基、4-咪唑啉基、1,2,4-噁二唑啉-3-基、1,2,4-噁二唑啉-5-基、1,2,4-噻二唑啉-3-基、

1,2,4-噻二唑啉-5-基、1,2,4-三唑啉-3-基、1,3,4-噁二唑啉-2-基、1,3,4-噻二唑啉-2-基、1,3,4-三唑啉-2-基、2,3-二氫呋喃-2-基、2,3-二氫呋喃-3-基、2,4-二氫呋喃-2-基、2,4-二氫呋喃-3-基、2,3-二氫噻吩-2-基、2,3-二氫噻吩-3-基、2,4-二氫噻吩-2-基、2,4-二氫噻吩-3-基、2-吡咯啉-2-基、2-吡咯啉-3-基、3-吡咯啉-2-基、3-吡咯啉-3-基、2-異噁唑啉-3-基、3-異噁唑啉-3-基、4-異噁唑啉-3-基、2-異噁唑啉-4-基、3-異噁唑啉-4-基、4-異噁唑啉-4-基、2-異噁唑啉-5-基、3-異噁唑啉-5-基、4-異噁唑啉-5-基、2-異噻唑啉-3-基、3-異噻唑啉-3-基、4-異噻唑啉-3-基、2-異噻唑啉-4-基、3-異噻唑啉-4-基、4-異噻唑啉-4-基、2-異噻唑啉-5-基、3-異噻唑啉-5-基、4-異噻唑啉-5-基、2,3-二氫吡唑-1-基、2,3-二氫吡唑-2-基、2,3-二氫吡唑-3-基、2,3-二氫吡唑-4-基、2,3-二氫吡唑-5-基、3,4-二氫吡唑-1-基、3,4-二氫吡唑-3-基、3,4-二氫吡唑-4-基、3,4-二氫吡唑-5-基、4,5-二氫吡唑-1-基、4,5-二氫吡唑-3-基、4,5-二氫吡唑-4-基、4,5-二氫吡唑-5-基、2,3-二氫噁唑-2-基、2,3-二氫噁唑-3-基、2,3-二氫噁唑-4-基、2,3-二氫噁唑-5-基、3,4-二氫噁唑-2-基、3,4-二氫噁唑-3-基、3,4-二氫噁唑-4-基、3,4-二氫噁唑-5-基、3,4-二氫噁唑-2-基、3,4-二氫噁唑-3-基、3,4-二氫噁唑-4-基、2-六氫吡啶基、3-六氫吡啶基、4-六氫吡啶基、1,3-二噁烷-5-基、2-四氫吡喃基、4-四氫吡喃基、2-四氫噻吩基、3-六氫嗒吡基、4-六氫嗒吡基、2-六氫嘧啶基、4-六氫嘧啶基、5-六氫嘧啶基、2-六氫吡嗪基、1,3,5-六氫三吡-2-基及 1,2,4-

六氫三吡-3-基；

雜芳基：未經取代或隨意地經取代之 5-至 15-員部份或完全不飽和的單-、二-或三環的環系統其中該環系統的至少一個環是完全不飽和，含有 1 至 4 個從包括氧、氮及硫的雜原子，如果此環含有多個氧原子，這些氧原子不直接相鄰；

例如(但不限於此)，

- 5-員雜芳基其含有 1 至 4 個氮原子或 1 至 3 個氮原子及 1 個硫或氧原子：5-員雜芳基其除了碳原子外，可含有 1 至 4 個氮原子或 1 至 3 個氮原子及 1 個硫或氧原子作為環成員，例如 2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、2-吡咯基、3-吡咯基、3-異噁唑基、4-異噁唑基、5-異噁唑基、3-異噻唑基、4-異噻唑基、5-異噻唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、2-咪唑基、4-咪唑基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,2,4-三唑-3-基、1,3,4-噁二唑-2-基、1,3,4-噻二唑-2-基及 1,3,4-三唑-2-基；

- 苯並-稠合的 5-員雜芳基其含有 1 至 3 個氮原子或 1 個氮原子及 1 個氧原子或硫原子：5-員雜芳基其除了碳原子外，可含有 1 至 4 個氮原子或 1 至 3 個氮原子及 1 個硫或氧原子作為環成員，且其中兩個相鄰的碳環成員或 1 個氮及 1 個相鄰的碳環成員可以經由丁-1,3-二烯-1,4-二基橋接其中 1 或 2 個碳原子可用氮原子替代；例如苯並吡啶基、苯並咪

唑基、苯並噻唑基、苯並吡唑基、苯並呋喃基；

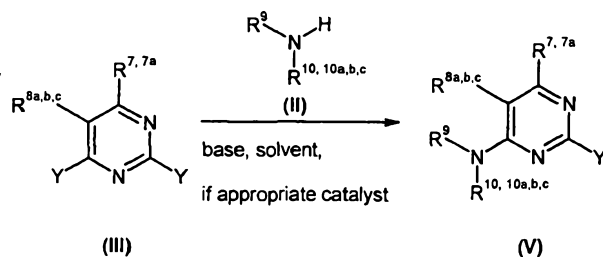
- 5-員雜芳基其含有 1 至 4 個氮原子且經由氮連結或苯並-合的 5-員雜芳基其含有 1 至 3 個氮原子且經由氮連結：5-員雜芳基其除了碳原子外，可含有 1 至 4 個氮原子或 1 至 3 個氮原子作為環成員，且其中兩個相鄰的碳環成員或 1 個氮及 1 個相鄰的碳環成員可以經由丁-1,3-二烯-1,4-二基橋接其中 1 或 2 個碳原子可用氮原子替代，其中這些環是經由其中一個氮環成員連結至主鏈，例如 1-吡咯基、1-吡唑基、1,2,4-三唑-1-基、1-咪唑基、1,2,3-三唑-1-基、1,3,4-三唑-1-基；

- 6-員雜芳基其含有 1 至 3 個或 1 至 4 個氮原子：6-員雜芳基其除了碳原子外，可含有 1 至 3 個或 1 至 4 個氮原子作為環成員，例如 2-吡啶基、3-吡啶基、4-吡啶基、3-嗒吡基、4-嗒吡基、2-嘧啶基、4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、1,3,5-三吡-2-基及 1,2,4-三吡-3-基；

不包括違反自然法則且從事此項技藝者根據其專業知識可以因此排除之組合。排除的是例如含有 3 個或更多相鄰的氧原子之環結構。

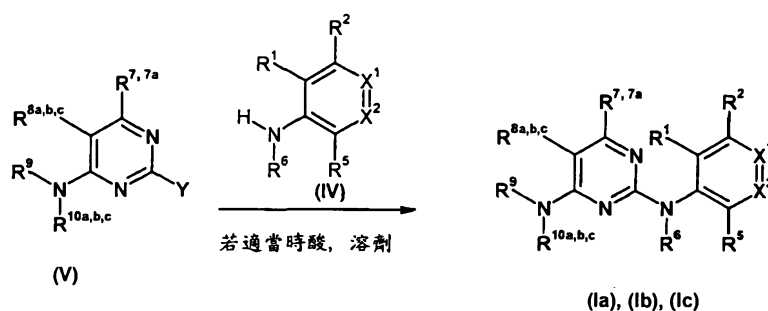
本發明還關於製備根據本發明之式(Ia)、(Ib)及(Ic)化合物之方法，其包括下面至少一個(a)至(F)之步驟：

(a) 根據下面的反應圖式(圖式 1)，式(III)之 2,4-二鹵基嘧啶與式(II)之胺在鹼存在下，如果適當時在溶劑存在下，如果適當時在觸媒存在下，反應而得到式(V)之化合物：



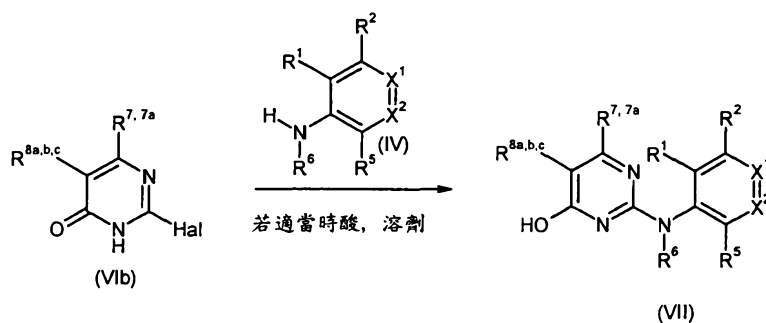
其中 $Y = F, Cl, Br, I$

(b) 根據下面的反應圖式(圖式 2), 式(V)之化合物與式(IV)之(雜)芳族胺如果適當時在酸存在下, 如果適當時在溶劑存在下反應:



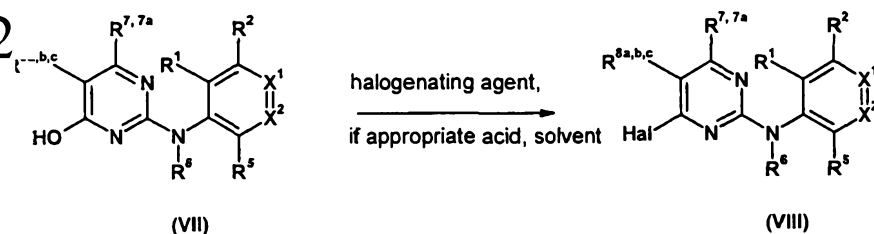
其中 $Y = F, Cl, Br, I$

(c) 根據下面的反應圖式(圖式 3), 式(VIb)之化合物與式(IV)之(雜)芳族胺如果適當時在酸存在下且如果適當時在溶劑存在下反應:



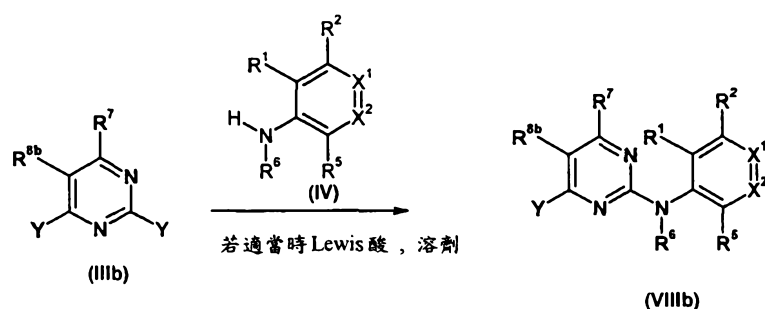
其中 $Hal = F, Cl, Br, I$

(d) 根據下面的反應圖式(圖式 4), 式(VII)之化合物與鹵化劑如果適當時在溶劑存在下反應而得到式(VIII)之化合物:



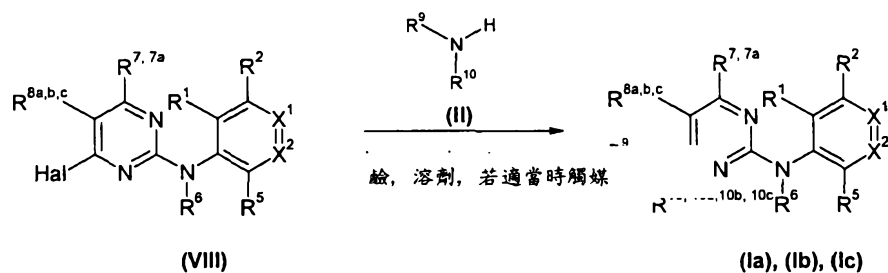
鹵化劑

根據下面的反應圖式 若適當時酸，溶劑 (VIIIb)之化合物與式(IV)之(雜)芳族胺如果適當時在觸媒存在下且如果適當時在溶劑存在下反應：



其中 $Y = F, Cl, Br, I$ 且 $R^{8b} = CF_3$

(e) 根據下面的反應圖式(圖式 6)，式(VIII)之化合物與式(II)之胺在鹼存在下，如果適當時在溶劑存在下，如果適當時在觸媒存在下，反應而得到式(Ia、Ib 及 Ic)之化合物：



其中在上面圖式之 R^1 至 R^{10} 及 X^1 與 X^2 基團之定義對應至該定義且 Y 及 Hal 代表 F, Cl, Br, I 。

一種製備中間物(V)之方法是列在圖式 1。

式(II)之烷基取代之胺基化合物是可得自商業化供應或根據文獻方法製備。一種製備合適的胺基化合物(II)之方法是例如還原對應的硝基化合物(揭示在例如 *J. Chem Soc*, 1947, 1474)、羧醯胺(揭示在例如 *J. Am. Chem Soc*, 1950, 72,

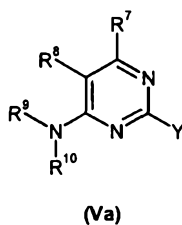
2657), 及還原對應的疊氮化物(揭示在例如 *Synth. Commun.* **1988**, 18, 1975)、肟(揭示在例如 *Org. Lett.* **2007**, 9, 2665)或腈(揭示在例如 *Org. Lett.* **2005**, 7, 1737)。合成式(II)之烷基取代之胺基化合物也可以經由還原性胺基化酮或醛類(揭示在例如 *J. Mol Cat*, **1999**, 146, 129)。製備式(II)之其他方法包括根據Gabriel解離對應的酞醯亞胺或胺基化烷基鹵化物(揭示在例如 *Tetrahedron Lett.* **1999**, 40, 4467)及烷基化對應的一級胺類(*Tetrahedron Assymm.* **2000**, 11, 1165)。

合適的2,4-二鹵基嘧啶(III)是可得自商業化供應或根據文獻方法製備, 例如從商業化供應的經取代之尿嘧啶(例如 $R^8 = CN$: *J. Org. Chem.* **1962**, 27, 2264、*J. Chem. Soc.* **1955**, 1834、*Chem. Ber.* **1909**, 42, 734; $R^8 = CF_3$: *J. Fluorine Chem.* **1996**, 77, 93; 以及見 WO 2000/047539)。

最初, 使用合適的鹼, 在從 $-30^{\circ}C$ 至 $+80^{\circ}C$ 之溫度, 在合適的溶劑例如二噁烷、THF、二甲基甲醯胺或乙腈中, 使胺(II)與2,4-二鹵基嘧啶(III)反應經1-24小時。合適使用的鹼是例如無機鹽類例如 $NaHCO_3$ 、 Na_2CO_3 或 K_2CO_3 , 有機金屬化合物例如LDA或NaHMDS, 或胺鹼例如乙基二異丙基胺、DBU、DBN或正三丁胺。或者是, 也可以根據例如 *Org. Lett.* **2006**, 8, 395之敘述, 藉助合適的過渡金屬觸媒例如鈀結合合適的配體例如三苯基膦或xanthphos進行反應。

部份式(V)化合物是新的且因此也形成本發明主題之一部份。

新的是式(Va)之化合物



其中

R^7 代表氫，

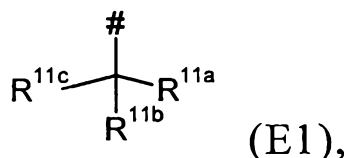
R^8 代表氯、碘、SMe、SOMe、SO₂Me、CF₃、CCl₃、CFH₂ 或 CF₂H，

R^9 具有上述的一般、較佳、特別較佳及非常特別較佳的意義，

Y = F、Cl、Br 或 I，

且

R^{10} 代表下式之 E1 基



其中符號定義如下且 # 代表連接至氮原子的點：

R^{11a} 代表氫或甲基，

R^{11b} 代表氫或 C₁-C₃-烷基，

R^{11c} 代表 C₂-C₄-烷基、CN、CH₂CN、CH(Me)CN、C(Me)₂CN、CH₂O-(C₁-C₃-烷基)、CH₂O-(C₁-C₃-鹵烷基)、C(Me)₂OH、C(Me)HO-(C₁-C₃-烷基)、C(Me)₂O-(C₁-C₃-烷基)、C(Me)HO-(C₁-C₃-鹵烷基)、C(Me)₂O-(C₁-C₃-鹵烷基)、CH₂S-(C₁-C₃-烷基)、C(Me)HS-(C₁-C₃-烷基)、C(Me)₂S-(C₁-C₃-烷基)、Si-(C₁-C₂-烷基)₃ 或 C₂-C₄-烯基其隨意地經鹵基或 CF₃ 取代，

或

R^{11c} 代表環戊基環其可隨意地經 CN、鹵基、 C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_3 -烷氧基、 C_1 - C_3 -鹵烷基、 C_1 - C_3 -鹵烷氧基、 C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基單-或多取代，

或

R^{11c} 代表環己基環其至少經一個選自 CN、鹵基、 C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_3 -烷氧基、 C_1 - C_3 -鹵烷基、 C_1 - C_3 -鹵烷氧基、 C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基之基團取代。

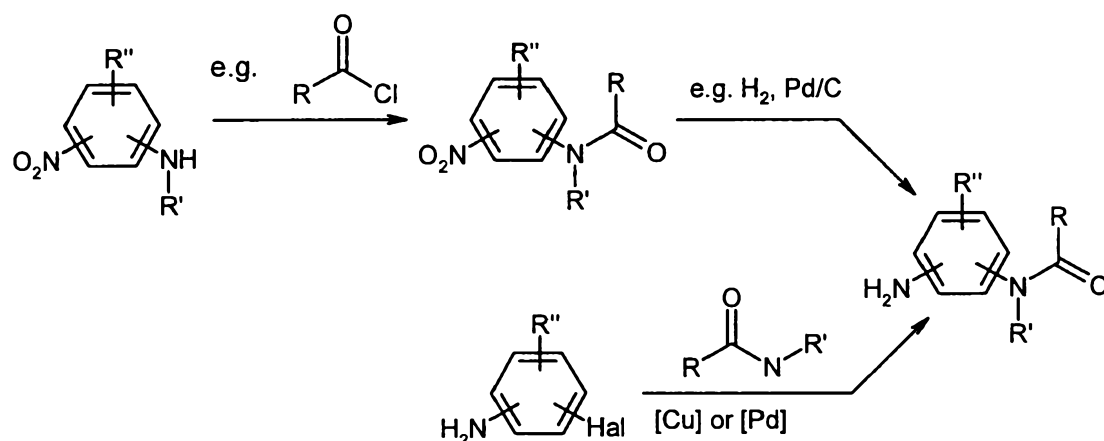
一種製備(Ia)、(Ib)及(Ic)化合物之方法列在圖式 2。

經取代之(雜)芳族胺(IV)是可得自商業化供應或可以經由從文獻已知的方法從可得自商業化供應的前驅物製備。在芳族部份帶有一或多個相同或不同取代基之(雜)芳族胺可以經由相關文下揭示之多種方法製備。下面敘述部份的方法作為實例。

磺醯胺-或磺酸酯取代之(雜)芳族胺可以例如經由文獻已知方法製備，使可得自商業化供應的胺基磺酸與氯化劑(例如 $POCl_3$)反應且隨後使形成的磺醯氯與 O-或 N-親核物反應。

圖式 7 概述製備 N-單醯基化的二胺基芳族類之兩種慣用的方法。據此，例如硝基苯胺類可以經由標準方法使用醯基鹵化物、氯甲酸酯或異(硫)氰酸酯轉化成對應的 N-醯基硝基芳族類，其可隨後經由文獻已知方法還原而得到 N-醯基胺基芳族類。另一種方法敘述經由過渡金屬催化使胺基鹵基芳族類與 N-醯基化合物交聯偶合化而製備該化合物(見例如 *J. Am. Chem. Soc.* **2001**, 123, 7727)。

圖式7: 合成 N-單鹽基化的二胺基芳族類



製備經由氮連結的R³或R⁴環狀基團可以經由例如縮合硝基胺基芳族類與鹵烷基羰基鹵化物或二酯類或二酯同等物或內酯類；隨後還原硝基而得到所要的(雜)芳族胺。合成N-連結的R³或R⁴基團之另一種方法是縮合硝基芳基胼類與二酯類或二酯同等物、炔丙酸酯或酮酯類。還原硝基而得到苯胺。

製備經取代之3-或4-胺基吡啶可以例如經由Hoffmann或Curtius降解對應的吡啶羧酸衍生物(例如*Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2006**, *16*, 3484)而還原經適當取代的硝基吡啶(例如WO2006074147)或胺基化經取代的鹵基吡啶(例如EP228846)。從文獻已知的其他方法在反應中包括對應的鹵基胺基吡啶與O-、N-或S-親核物(例如*Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2002**, *12*, 1517)及C-親核物(例如*Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2000**, *10*, 2383)。其他方法敘述經由過渡金屬催化將胺基鹵基吡啶交聯偶合而製備所提到的化合物(WO2006025979)。

中間物(V)在Brönstedt酸例如無水氫氯酸、樟腦磺酸或對-甲苯磺酸存在下，在合適的溶劑例如二噁烷、THF、DMSO、DME、2-甲氧基乙醇、正丁醇或乙腈中，在0°C-140°C之溫度下與(雜)芳族胺(IV)反應經1-48小時。此類似地敘述於例如 *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2006**, *16*, 2689、GB2002 A1-2369359, *Org. Lett.* **2005**, *7*, 4113。

或者是，(V)與(IV)反應而得到(Ia)、(Ib)或(Ic)也可以在鹼-催化下進行，也就是使用例如碳酸鹽例如碳酸鉀、醇鹽例如第三丁醇鉀、或氫化物例如氫化鈉，其中催化用途也可以使用過渡金屬例如鈀結合合適的配體例如 xanthphos。

最後，可以在沒有溶劑及/或Brönstedt酸進行(V)與(IV)的反應而得到(I) (揭示在例如 *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2006**, *16*, 108、*Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2005**, *15*, 3881)。

圖式3列出一種製備式(VII)化合物之方法。

2-鹵基-取代之嘧啶-4-酮(VIb)可以經由配向選擇性的水解得自 2,4-二鹵基-取代之嘧啶。此係揭示在例如 *Russ. J. Org. Chem.* **2006**, *42*, 580、*J. Med. Chem.* **1965**, *8*, 253。

式(VIb)之中間物在Brönstedt酸例如無水氫氯酸、樟腦磺酸或對-甲苯磺酸存在下，在合適的溶劑例如二噁烷、THF、DMSO、DME、2-甲氧基乙醇、正丁醇或乙腈中，在0°C-140°C之溫度與(雜)芳族胺(IV)反應經1-48小時。

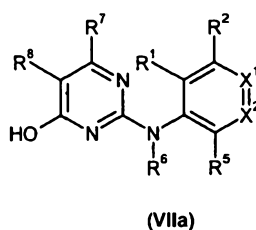
或者是，(VIb)及(IV)反應而得到(VII)也可以在鹼-催化下進行，也就是使用例如碳酸鹽例如碳酸鉀、醇鹽例如第

三丁醇鉀、或氫化物例如氫化鈉，其中催化用途也可以使用過渡金屬例如鈀結合合適的配體例如xanthphos。

最後，可以在沒有溶劑及/或Brönstedt酸進行(VIb)與(IV)的反應而得到(VII) (揭示在例如 *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2006**, *16*, 108、*Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2005**, *15*, 3881)。

部份式(VII)化合物是新的且因此也形成本發明主題之一部份。

新的是式(VIIa)之化合物



其中符號定義如下：

X^1 、 X^2 、 R^1 至 R^6 、 R^{12} 及 R^{13} 具有上述的一般、較佳、特別較佳、非常特別較佳及尤其較佳的意義，

R^7 代表氫，

R^8 代表氯、溴、碘、 CFH_2 、 CF_2H 、 CF_3 、 CCl_3 、 SMe 、 $SOMe$ 或 SO_2Me ，

先決條件是如果

$R^1=R^2=R^5=$ 氫且 $X^2=CH$ ，

R^3 必須不是代表氫、 CO_2H 、 $(CH_2)_2OH$ 、 SMe 、 $SOMe$ 、或氰基，

或

先決條件是如果

$R^1=R^5$ =氫且 $X^1=CH$,

R^2 及 R^4 都不是代表 OH 或 $CONH_2$ 。

圖式4列出一種製備式(VIII)化合物之方法。

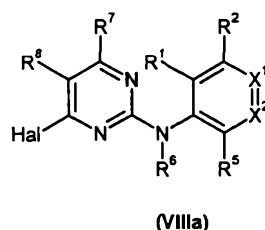
式(VII)之中間物，經由與合適的鹵化劑例如亞硫醯氯、五氧化磷或磷醯氯或其混合物反應，如果適當時在合適的溶劑例如甲苯或乙醇存在下，且如果適當時在合適的鹼例如三乙胺存在下，可以轉化成式(VIII)之2-苯胺基-4-氯嘧啶。此係類似地揭示在例如 *J. Med. Chem.* **1989**, 32, 1667、*J. Heterocycl. Chem.* **1989**, 26, 313。

圖式5列出從2,4-二鹵基嘧啶(IIIb)及芳族胺(IV)製備式(VIIIb)化合物之另一種方法。

使用合適的路易士酸或合適的鹼，在從 $-15^{\circ}C$ 至 $100^{\circ}C$ 之溫度病在合適的惰性溶劑例如1,4-二噁烷、乙醚、THF、正丁醇、第三丁醇、二氯乙烷或二氯甲烷中，(雜)芳族胺(IV)與2,4-二鹵基嘧啶(IIIb)反應經1-24小時。合適作為鹼使用的是例如無機鹽類例如 $NaHCO_3$ 、 Na_2CO_3 或 K_2CO_3 ，有機金屬化合物例如LDA或NaHMDS，或胺鹼例如乙基二異丙基胺、DBU、DBN或正三丁胺。合適作為路易士酸使用的是例如(但不限於此)鋅、鎂、酮、錫或鈦金屬之鹵化物(例如 $ZnCl_2$) (見例如US 2005/0256145或WO 05/023780 及其中列出的文獻)。

部份式(VIII)化合物是新的且因此也形成本發明主題之一部份。

新的是式(VIIIa)之化合物



其中符號定義如下：

X^1 、 X^2 、 R^2 至 R^4 、 R^{12} 及 R^{13} 具有上述的一般、較佳、特別較佳、非常特別較佳及尤其較佳的意義，且

Hal 代表氟、氯、溴或碘，

R^8 代表氯、溴、碘、Me、 CF_3 、 CFH_2 、 CF_2H 、 CCl_3 及氰基，

R^1 、 R^5 、 R^6 及 R^7 代表氫，

先決條件是如果

$X^2=CH$ 且 $X^1=CR^3$ ，

R^3 不是代表 $CON(Me)$ -4-(N-甲基六氫吡啶基)、N-六氫吡啶基、 CO -1-(4-甲基六氫吡啶基)、N-嗎福啉基、 SO_2Me 、 $CONH_2$ 、Me、OMe、 COO -苄基、 $COOH$ 、CN、 NO_2 、 NMe_2 或 Cl，

或

先決條件是如果

$X^1=CH$ 且 $X^2=CR^4$ ，

R^2 或 R^4 不是代表 CN、Cl 或 5-噁唑基，

或

先決條件是如果

$X^1=CR^3$ 且 $X^2=CR^4$,

R^2 、 R^3 及 R^4 不是代表氯,

或

先決條件是如果

$R^8=CF_3$,

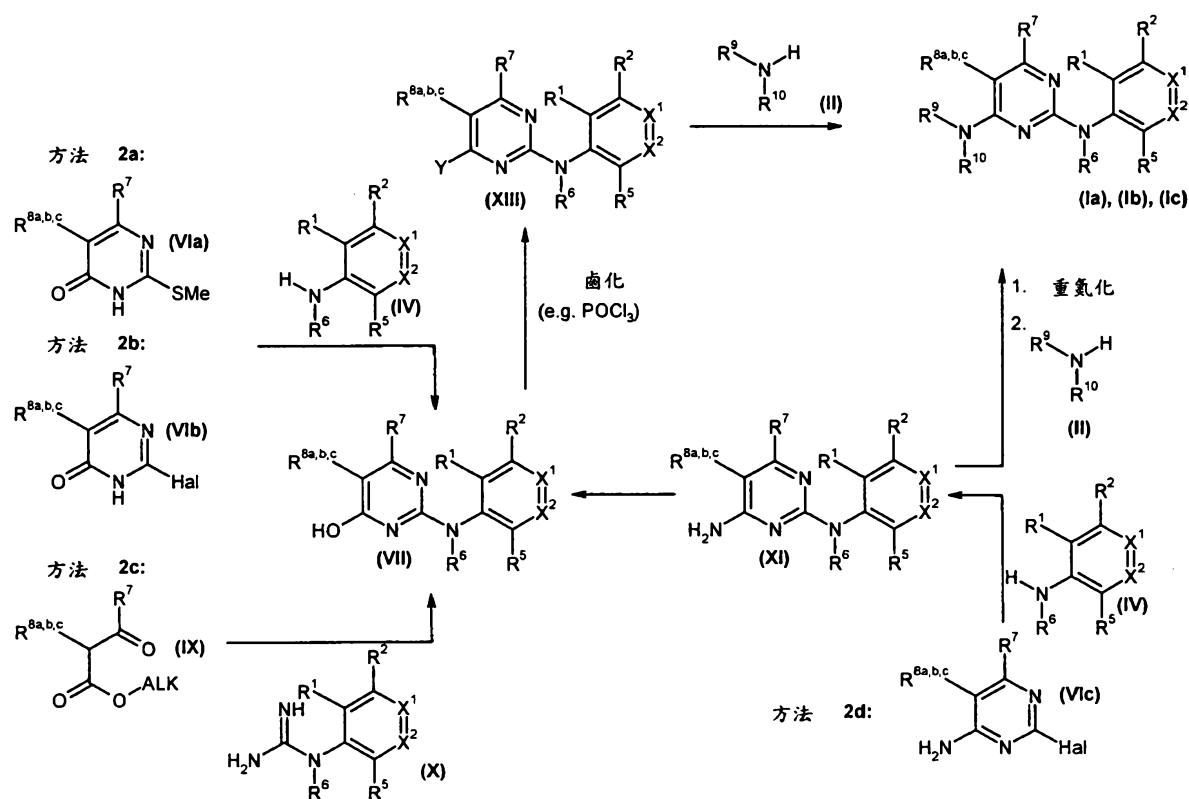
R^3 及 R^4 一起不是形成飽和或部份不飽和的雜環。

圖式 6 列出製備化合物(Ia)、(Ib)或(Ic)之另一種方法。

為了製備式(Ia)、(Ib)或(Ic)之化合物, 在鹼例如碳酸鹽例如碳酸鉀、醇鹽例如第三丁醇鉀、或氫化物例如氫化鈉或胺鹼存在下, 在合適的溶劑例如二噁烷、THF、DMSO、DME、2-甲氧基乙醇、正丁醇或乙腈中, 在 $0^{\circ}C$ - $140^{\circ}C$ 之溫度下, 中間物(VIII)與式(II)之胺反應經 1-48 小時, 其中催化用途也可以使用過渡金屬例如鈀結合合適的配體例如三苯基膦或 xanthphos。

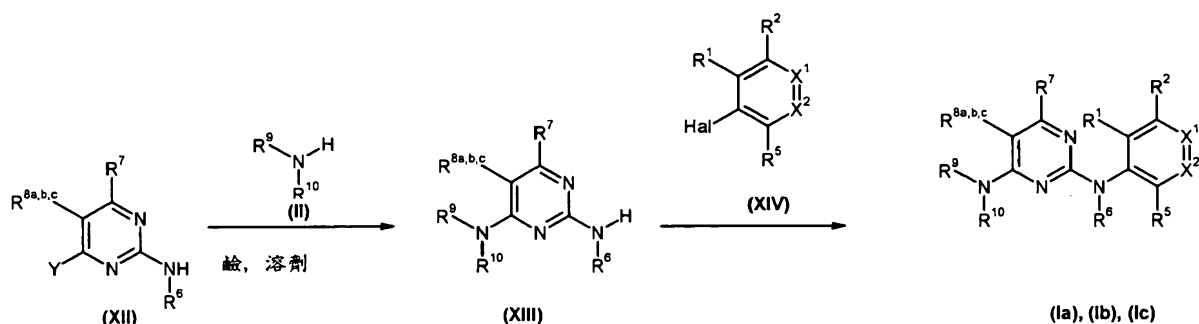
通常, 也可能選擇不同的途徑製備根據本發明之化合物(Ia)、(Ib)、(Ic)及(I), 如圖式 8 所示。

圖式 8



圖式9列出製備式(Ia)、(Ib)及(Ic)之二氨基嘧啶之另一種方法：

圖式 9



用4-鹵基-取代之2-氨基嘧啶(XII)開始，其可例如類似於(VIII)從式(VIa)、(VIb)或(IX)化合物經由與R⁶-胺反應且隨後在4-位置氯化而製備，加入胺基化合物(II)後，可能得到某些二氨基嘧啶(XIII)。在過渡金屬催化的後續步驟中，

這些可以與芳基鹵化物(XIV)反應(揭示在例如 *Org. Lett.* 2002, 4, 3481)而得到所要的標靶化合物(Ia)、(Ib)、(Ic)。

根據本發明用於製備式(Ia)、(Ib)及(Ic)化合物之方法較宜使用一或多種反應輔劑進行。

如果適當時，合適的反應輔劑是慣用的無機或有機鹼或酸受體。這些較宜包括鹼金屬及鹼土金屬醋酸鹽、氮化物、碳酸鹽、碳酸氫鹽、氮化物、氮氧化物及醇鹽，例如醋酸鈉、醋酸鉀或醋酸鈣、氮化鋰、氮化鈉、氮化鉀或氮化鈣、碳酸鈉、碳酸鉀或碳酸鈣、碳酸氫鈉、碳酸氫鉀或碳酸氫鈣、氮化鋰、氮化鈉、氮化鉀或氮化鈣、氮氧化鋰、氮氧化鈉、氮氧化鉀或氮氧化鈣、甲醇、乙醇、正-或異丙醇、正-、異-、第二-或第三丁醇鈉或甲醇、乙醇、正-或異丙醇、正-、異-、第二-或第三丁醇鉀；以及鹼性有機氮化合物例如三甲胺、二環己基胺、乙基二環己基胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苄基胺、吡啶、2-甲基-、3-甲基-、4-甲基-、2,4-二甲基-、2,6-二甲基-、3,4-二甲基-及3,5-二甲基吡啶、5-乙基-2-甲基吡啶、4-二甲基氨基吡啶、N-甲基六氫吡啶、1,4-二氮雜二環[2.2.2]辛烷(DABCO)、1,5-二氮雜二環[4.3.0]壬-5-烯(DBN)或1,8-二氮雜二環[5.4.0]十一烷-7-烯(DBU)。

根據本發明之方法較宜使用一或多種稀釋劑進行。合適的稀釋劑實質上是全部的惰性有機溶劑。這些較宜包括脂族及芳族、隨意經鹵化之烴類，例如戊烷、己烷、庚烷、環己烷、石油醚、汽油、石油英、苯、甲苯、二甲苯、二

氯甲烷、二氯乙烷、氯仿、四氯化碳、氯苯及鄰-二氯苯，醚類例如乙醚及二丁醚、乙二醇二甲醚及二乙二醇二甲醚、四氫呋喃及二噁烷，酮類例如丙酮、甲基乙基酮、甲基異丙基酮或甲基異丁基酮，酯類例如醋酸甲酯或醋酸乙酯，腈類例如乙腈或丙腈，鹽胺類例如二甲基甲鹽胺、二甲基乙鹽胺及N-甲基吡咯酮，以及二甲亞砜、環丁砜及六甲基磷三鹽胺及DMPU。

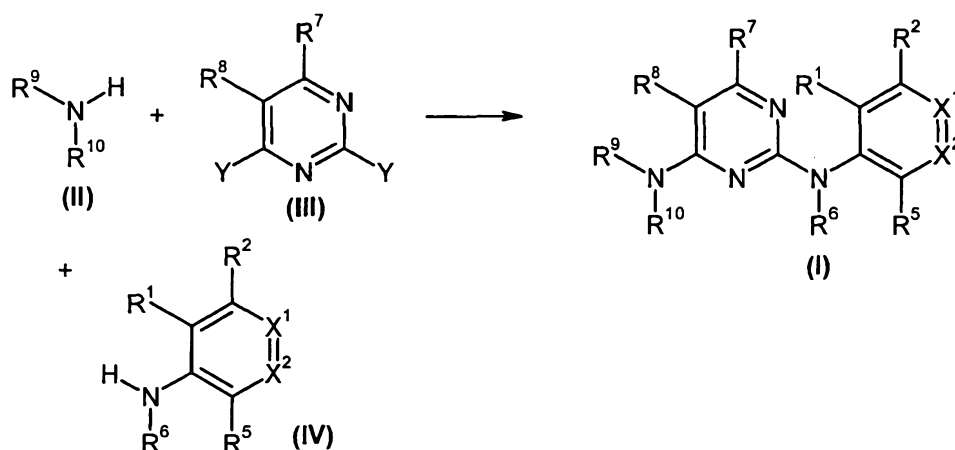
在根據本發明之方法中，反應溫度可以在相當大的範圍內變化。通常，該方法是在0°C及250°C之間的溫度進行，較宜在10°C及185°C之間的溫度。

根據本發明之方法通常是在大氣壓力下進行。但是，也可能在升壓或減壓下進行。

進行根據本發明之方法時，在各情形下所需的起始物質通常使用約等克分子量。但是，在各情形下也可使用相當大過量的其中一種成份。在根據本發明之方法中的處理，在各情形下是經由慣用的方法進行(參見製備實例)。

通常，式(I)化合物可以例如經由依序親核性添加脂族胺(II)及(雜)芳族胺(IV)至經適當取代之嘧啶(III)而製備，如下面圖式 10 所示：

圖式 10



在此，Y在各情形下彼此獨立地代表合適的釋離基，例如鹵素原子(Hal = F、Cl、Br、I)、SMe、SO₂Me、SOMe或者是三氟甲基磺酸酯(CF₃SO₂O：對於嘧啶已知自WO 05/095386)。

根據圖式 8 或其他途徑，式(I)之二胺基嘧啶類之合成經揭示在文獻中的許多不同情形下(見例如 WO 06/087230、WO 05/111022、WO 05/111023、WO 05/037800、WO 04/065378、WO 04/056786、WO 04/056807、WO 04/048343、WO 03/032997、WO 03/030909、WO 02/096888)。

本發明還提供根據本發明之二胺基嘧啶類或其混合物用於控制不要的微生物之非醫藥用途。

本發明還提供一種組成物用於控制不要的微生物，其含有至少一種根據本發明之二胺基嘧啶類。

本發明也關於一種用於控制不要的微生物之方法，其特徵是將根據本發明之二胺基嘧啶類施加至微生物及/或其住所。

根據本發明之化合物具有強烈的殺菌作用且可以在農作物保護及物質之保護中用於控制不要的微生物，例如真菌及細菌。

根據本發明之式(I)之二胺基嘧啶類具有非常良好的殺真菌性質且可以在農作物保護中使用，例如用於控制根瘤菌、卵菌綱、壺菌、接合菌、子囊菌，擔子菌和半知菌類。

在農作物保護中，殺菌劑可以用於控制假單包菌、根瘤菌、腸桿菌、棒狀桿菌及鏈黴菌。

根據本發明之殺真菌的組成物可以用在治病或保護性的控制植物病源有害的真菌。據此，本發明也關於使用根據本發明之活性化合物或組成物用於控制植物病源有害的真菌之治病或保護性的方法，其係施加至種子、植物或植物部份、果實或植物生長之土壤上。

在農作物保護中用於控制植物病源有害的真菌之根據本發明之組成物，含有有效但是不會危害植物的量之根據本發明之活性化合物。「有效但是不會危害植物的量」係指根據本發明之組成物的量在滿意的方式下足夠控制植物的真菌病或完全消除真菌病，且其同時不會造成危害植物之任何明顯症狀。通常，此施加率可以在相當大的範圍內變化。其取決於多種因子，例如需要控制的真菌、植物、氣候條件及根據本發明之組成物的成份。

根據本發明，可以處理整個植物及部份的植物。植物在此係指全部的植物及植物種數，例如要與不要的野生植物或農作物(包括天然出現的農作物)。

農作物可以是經由傳統栽種與最適化方法或經由生物技術與基因工程方法或這些方法之組合所得的植物，包括基因轉移的植物並包括可以或不可以經由變種財產權保護的栽培變種植物。部份的植物係指植物在地面上及地面下的部份及器官，例如芽、葉、花及根，可列舉的實例是葉、針、莖、軀幹、花、子實體、果實及種子以及根、塊莖及根莖。部份的植物也包括收割的物質及有生長力與生殖力繁殖的物質，例如幼苗、塊莖、根莖、切枝及種子。

可以列舉下面的植物作為可以根據本發明處理的植物：棉花、亞麻、葡萄、水果、蔬菜例如薔薇科(例如仁果類水果例如蘋果及梨，以及核果例如杏樹、櫻桃、杏仁、桃子和軟水果例如草莓)、Ribesioideae 科、胡桃科、樺木科、漆樹科、殼鬥科、桑科、木犀科、獼猴桃科、樟科、芭蕉科(例如香蕉樹及種植園)、茜草科(例如咖啡)、山茶科、梧桐科、芸香科(例如檸檬、柳橙及柚子)、茄科(例如番茄)、百合科、菊科、(例如生菜)、繖形科、十字花科、藜科、葫蘆科(例如黃瓜)、蔥科(例如韭菜、洋蔥)、蝶形花科(例如豌豆)；主要農作物例如禾本科(例如玉米、草坪、穀物例如小麥、黑麥、大米、大麥、燕麥、小米、黑小麥)、菊科(例如向日葵)、十字花科(例如白菜、紅色捲心菜、西蘭花、花椰菜、甘藍、白菜、大頭菜、萵苣、以及油菜、芥菜、辣根和水芹)、豆科(例如蠶豆、豌豆)、蝶形花科(例如大豆)、茄科(例如馬鈴薯)、藜科(例如甜菜、飼料甜菜、瑞士甜菜、甜菜)；在花園及森林的農作物及觀賞植物，以及這些植物

在各情形下的基因改良變種。穀類植物較宜根據本發明處理。

可以根據本發明處理的針菌病之部份病原體，可以舉例作為實例，但不限於此：

經由白粉病病原體造成的疾病，例如 *Blumeria* 屬例如小麥白粉病；*Podosphaera* 屬例如蘋果白粉病；*Sphaerotheca* 屬例如瓜類白粉病；*Uncinula* 屬例如葡萄白粉病；

經由銹病病原體造成的疾病，例如 *Gymnosporangium* 屬例如梨銹病；*Hemileia* 屬例如咖啡銹病；*Phakopsora* 屬例如大豆銹病及豆薯銹病；*Puccinia* 屬例如小麥銹病 (*Puccinia recondita* 或 *Puccinia triticina*)；*Uromyces* 屬例如菜豆銹病；

經由從卵菌門的病原體造成的疾病，例如 *Bremia* 屬例如萵苣露菌病；*Peronospora* 屬例如豌豆霜霉病 (*Peronospora pisi* 或 *P. brassicae*)；*Phytophthora* 屬例如番茄晚疫病；*Plasmopara* 屬例如葡萄霜霉病；*Pseudoperonospora* 屬例如啤酒花藤白菌病或黃瓜霜霉病；*Pythium* 屬例如豌豆根腐病；

經由下列造成的葉斑病及葉枯病，例如經由 *Alternaria* 屬例如番茄早疫病；*Cercospora* 屬例如波菜褐斑病；*Cladosporium* 屬例如黃瓜黑星病；*Cochliobolus* 屬例如麥類斑點病(孢子形式：臍蠕孢, Syn: *Helminthosporium*)；*Colletotrichum* 屬例如菜豆炭疽病；*Cycloconium* 屬例如油橄欖孔雀斑病；*Diaporthe* 屬例如柑橘蒂腐病；*Elsinoe* 屬例

如柑橘瘡痂病；Gloeosporium 屬例如桃炭疽病；Glomerella 屬例如油茶炭疽病；Guignardia 屬例如葡萄黑腐病；Leptosphaeria 屬例如油菜黑斑病；Magnaporthe 屬例如稻瘟病；Microdochium 屬例如禾草粉紅雪霉病；Mycosphaerella 屬例如莓斑葉病及香蕉斑葉病；Phaeosphaeria 屬例如小麥葉枯病；Pyrenophora 屬例如大麥網斑病；Ramularia 屬例如 Ramularia collo-cygni；Rhynchosporium 屬例如大麥雲紋病；Septoria 屬例如芹菜斑枯病；Typhula 屬例如血脈雪腐病；Venturia 屬例如蘋果黑星病；

經由下列造成的根及莖疾病，例如經由 Corticium 屬例如稻紋枯病；Fusarium 屬例如金線蓮莖腐病；Gaeumannomyces 屬例如小麥全蝕病；Rhizoctonia 屬例如百合根腐病；Tapesia 屬例如稻瘟病；Thielaviopsis 屬例如菸草根腐病；

經由下列造成的穗及圓錐花序疾病(包括玉米芯)，例如經由 Alternaria 屬例如鏈格菌；Aspergillus 屬例如黃麴菌；Cladosporium 屬例如瓜枝孢菌；Claviceps 屬例如麥角菌；Fusarium 屬例如黃色鐮刀菌；Gibberella 屬例如小麥赤霉病；Monographella 屬例如小麥雪霉病；Septoria 屬例如小麥穎枯病；

經由黑粉菌造成的疾病，例如 Sphacelotheca 屬例如玉米絲黑穗病；Tilletia 屬例如小麥網腥黑穗病、小麥矮化腥黑穗病；Urocystis 屬例如黑麥桿黑穗病；Ustilago 屬例如裸麥黑粉病、小麥散黑粉病；

經由下列造成的果實腐爛，例如經由 *Aspergillus* 屬例如黃麴菌；*Botrytis* 屬例如灰霉菌；*Penicillium* 屬例如擴展青霉及產紫青霉；*Sclerotinia* 屬例如菌核菌；*Verticillium* 屬例如黃萎菌；

經由下列造成的種子-及土壤-傳播的腐爛及枯萎病以及幼苗疾病，例如經由 *Fusarium* 屬例如黃色鐮刀菌；*Phytophthora* 屬例如戀疫霉；*Pythium* 屬例如終極腐霉菌；*Rhizoctonia* 屬例如立枯絲核菌；*Sclerotium* 屬例如白絹菌；

經由例如 *Monilinia* 屬造成的瘤性疾病、癭及掃帚病，例如蘋果樹枝潰瘍菌；

經由例如 *Nectria* 屬造成的枯萎疾病，例如桃褐腐菌；

經由例如 *Taphrina* 屬造成的葉子、花及果實變形，例如畸形外囊菌；

經由例如 *Esca* 屬造成的木本植物之退化性疾病，例如 *Phaemoniella clamydospora*、*Phaeoacremonium aleophilum* 及 *Fomitiporia mediterranea*；

經由例如 *Botrytis* 屬造成的花及種子之疾病，例如灰霉菌；

經由下面造成的植物塊莖之疾病，例如 *Rhizoctonia* 屬例如立枯絲核菌；*Helminthosporium* 屬例如長蠕孢菌；

經由細菌性植物病原體造成的疾病，例如 *Xanthomonas* 屬例如甘藍黑腐菌；*Pseudomonas* 屬例如胡瓜細菌性斑點菌；*Erwinia* 屬例如梨火疫病病原細菌。

較宜控制大豆的下列疾病：

在葉子、莖、豆莢及種子上經由下列造成的真菌疾病，例如紫斑病(*Alternaria spec. atrans tenuissima*)、炭疽病(*Colletotrichum gloeosporoides dematium var. truncatum*)、赤星病(大豆褐紋病菌)、葉斑病及枯萎病(大豆紫斑病菌)、雪霉葉枯病(*Choanephora infundibulifera trispora* (Syn.))、疏毛核菌霉葉斑病(*Dactuliophora glycines*)、霜霉病(毛豆露菌病菌)、德氏霉葉枯病(*Drechslera glycini*)、灰斑病(大豆灰斑病菌)、菜豆葉斑病(三葉草胡麻斑病菌)、黑星病(大豆灰星病菌)、豆莢及莖枯萎(大豆莖黑點霉)、白粉病(厚朴白粉病菌)、棘殼孢葉枯病(*Pyrenochaeta glycines*)、絲核菌葉枯病(立枯絲核菌)、銹病(豆薯屬銹菌)、結痂(黑痘病菌)、葉黑腐病(蒿苳灰斑病菌)、斑點病(火鶴花花腐病菌)。

在根及莖部份經由下列造成的真菌疾病，例如黑根腐病(*Calonectria crotalariae*)、炭腐病(菜豆殼球孢菌)、立枯病或萎蔫病、根腐病、及豆莢與基腐病(尖鏟孢菌、直喙鏟孢菌、半裸鏟刀菌、木賊鏟刀菌)、肉座菌根腐病(大豆枯萎病菌)、莢果黑斑病(*Neocosmopora vasinfecta*)、根及莖枯萎病(大豆黑點病菌)、枝枯病(大豆北方莖潰瘍病菌)、疫病(大豆疫霉病菌)、褐莖腐病(大豆莖褐腐病菌)、腐黴菌腐爛病(坪草腐霉枯萎病菌、畸雌腐霉菌、德巴利腐霉菌、薑軟腐病菌、豌豆根腐病菌)、蠶豆絲核菌根腐病、莖腐爛及猝倒病(*Rhizoctonia solani*)、菌核病莖腐爛(菌核菌)、白絹病(白絹菌)、海芋細菌性軟腐病(菸草根腐霉)。

在本發明中，不要的微生物係指植物致病性真菌及細

菌。據此，根據本發明之物質可以用於保護植物在處理後的一段時間內抵抗上述病原體之攻擊。植物經活性化合物處理後，保護之有效期間通常從 1 延伸至 10 天，較宜是 1 至 7 天。

植物對用於控制植物疾病所需的活性化合物之濃度耐受良好之事實，使得可以處理空中的植物部份、植物繁殖物質及種子、以及土壤。

在本文中，根據本發明之活性化合物可以特別成功地用無控制穀類疾病，例如對抗白粉菌屬、對抗銹病菌及對抗鏈孢菌屬，稻米疾病例如對抗稻瘟菌及立枯絲核菌以及在葡萄栽培、水果生產與蔬菜生產中的疾病例如對抗灰黴菌、黑星菌、白粉菌(*Sphaerotheca*)及白粉菌(*Podosphaera*)屬。

根據本發明之活性化合物也合適用於增加產量。而且，其顯現低度的毒性且植物耐受良好。

如果適當時，根據本發明之活性化合物在某種濃度或使用率下，也可以作為除草劑、安全劑、生長調節劑或改良植物性質的藥劑使用，或作為殺微生物劑，例如作為殺真菌劑、抗黴菌劑、殺菌劑、殺病毒劑(包括抗擬病毒的藥劑)或作為抗 MLO (擬菌質體)及 RLO (類立克次體)的藥劑。如果適當時，其也可以作為殺昆蟲劑使用。如果適當時，其也可以作為合成其他活性化合物的中間體或前驅物使用。

如果適當時，根據本發明之活性化合物也可以在某種

濃度及使用率下作為除草劑使用病用於影響植物生長。如果適當時，其也可以作為合成其他活性化合物的中間體或前驅物使用。

根據本發明之活性化合物，結合良好的植物耐受性及對溫血動物有合適的毒性且良好的環境相容性，合適用於保護植物及植物器官，用於增加收穫產量及在農業、園藝、動物飼養、森林、花園及休閒設施、在儲存的產品及原料之保護、及在衛生部門中用於改良收穫物質之品質。其較宜作為植物保護劑使用。其可以活性對抗通常是敏性及抗藥性的物種及對抗全部或個別的發育階段。

根據本發明用活性化合物或組合物處理植物或植物部份是使用慣用的處理方法直接進行或作用在其環境、住所或儲存室，例如經由浸漬、噴灑、霧化、灌溉、蒸發、撒播、噴霧、散播、泡沫化、塗覆、散佈、澆水(浸溼)、滴水灌溉，以及在播種物質之情形中，特別是在種子之情形，還可以作為粉末用於乾式種子處理、溶液用於溼式種子處理、水溶性粉末用於稠漿處理、經由形成外皮、經由塗覆一或多個塗層等。還可以經由超低體積法施加活性化合物或將活性化合物製劑或活性化合物本身注射至土壤內。

根據本發明用活性化合物也可以作為落葉劑、乾燥劑、殺稻草劑且特別是作為殺雜草劑使用。雜草廣泛地係指在處所中生長之不要的全部植物。根據本發明之化合物作為全部或選擇性的除草劑，實質上是取決於施加的量。

此外，根據本發明之處理，可以重複使用在收穫的物

質及從其製備的食物-及飼料中的真菌毒素成份。特別但是非限定，在此可列舉的真菌毒素是：例如經由下面的真菌生產之脫氧雪腐鏟刀菌烯醇(DON)、雪腐鏟刀菌烯醇、15-Ac-DON、3-Ac-DON、T2-及 HT2-毒素、伏馬鏟孢毒素、玉米赤霉烯酮、串珠鏟刀菌素、鏟刀菌素、二醋酸蔗草鏟刀菌烯醇(DAS)、白僵菌素、恩鏟孢菌素、伏薩菌素(fusaroproliferin)、伏薩烯醇(fusarenol)、赭麴毒素、展青黴素、麥角生物鹼及黃麴毒素：尤其是鏟刀菌屬，例如銳頂鏟刀菌、燕麥鏟刀菌、*F. crookwellense*、黃色鏟刀菌、禾谷鏟刀菌(*Gibberella zeae*)、木賊鏟刀菌、*F. fujikuroi*、*F. musarum*、尖鏟刀菌、再育鏟刀菌、梨孢鏟刀菌、*F. pseudograminearum*、接骨木鏟刀菌、蔗草鏟刀菌、半裸鏟刀菌、茄鏟刀菌、枝抱鏟刀菌、*F. langsethiae*、胶孢鏟刀菌、三線鏟刀菌、輪狀鏟刀菌，以及尤其是經由曲霉真菌屬、青霉素屬、麥角菌、黑霉菌屬。

在材料之保護中，根據本發明之組成物或活性化合物還可用於保護工業材料抵抗不要的微生物例如真菌之攻擊及破壞。

在本文中，工業材料係指在科技中使用的無生命物質。例如，經由根據本發明的活性化合物保護而免於受到微生物改變或破壞之工業材料可以是膠水、膠料塗料、紙及卡片、紡織品、皮革、木材、塗料及塑膠製品、冷卻潤滑劑及可以受到微生物攻擊或破壞的其他材料。

製造工廠之零件，例如冷卻水電路，其也會受到微生

物繁殖的負面影響，也可以列在受保護之材料範圍內。

較宜列舉在根據本發明目的之工業材料是膠水、膠料塗料、紙及卡片、皮革、木材、塗料、冷卻潤滑劑及熱交換流體，尤其較宜是木材。根據本發明之組成物或活性化合物可以預防不利的效應例如腐爛、衰退、退色、脫色或霉菌形成。

根據本發明用於控制不要的真菌之方法也可以用於保護儲存的作品。在此，儲存的作品係指需要長期保護之植物或動物來源之天然物質或其天然來源之加工產物。植物來源之儲存的作品，例如植物或植物的部份，例如莖、葉、塊莖、種子、果實、穀粒，可以在剛採收時或經由(預)乾燥、潤濕、粉末化、研磨、擠壓或烘烤加工後保護。儲存的作品也包括木材，包括未加工的例如建築木材，電線桿及柵欄，或完成產品的形式例如傢具。動物來源之儲存的作品是例如獸皮、皮革、毛皮及毛髮。根據本發明之活性化合物組合可以預防不利的效應例如腐爛、衰退、退色、脫色或霉菌形成。

可以降解或改變工業材料之微生物實例是例如細菌、真菌、酵母菌、藻類及分泌黏液的微生物。根據本發明之活性化合物較宜作用對抗真菌，特別是霉菌、木材脫色性及木材破壞性的真菌(擔子菌門)及對抗分泌黏液的微生物及藻類。下面種類的微生物可以列舉作為實例：鏈格菌屬例如鏈格孢菌；曲霉屬例如黑曲霉；球毛殼霉菌屬例如球毛殼霉菌；粉孢革菌屬例如粉孢革菌；香菇菌屬例如虎皮

香菇菌；青霉屬例如青霉菌；多孔菌屬例如變色多孔菌；短梗霉屬例如短梗霉；掃枝霉屬例如 *Sclerophoma pityophila*；木霉屬例如綠色木霉；桿菌屬例如大腸桿菌；銅綠假單包菌屬例如銅綠假單包菌；葡萄球菌屬例如金黃葡萄球菌。

本發明還關於含有其中一種根據本發明的二胺基嘧啶類之組成物用於控制不要的微生物。這些較宜是含有合適在農業中使用的輔劑、溶劑、載劑、表面活性劑或延伸劑之殺真菌組成物。

根據本發明，載劑係指一種天然或合成、有機或無機物質，活性物質可以與其混合或結合而有較佳的適用性，特別是應用至植物或植物部份或種子。該載劑可以是固體或液體，通常是惰性，且其必須能在農業上使用。

合適的固體或液體載劑是：例如銨鹽及粉碎的天然礦物例如高嶺土、黏土、滑石、石灰、石英、矽鎂土、蒙脫土或矽藻土，及粉碎的合成礦物例如微細分粒的二氧化矽、氧化鋁及矽酸鹽；用於粒劑之合適的固體載劑是：例如壓碎且分級的天然岩石例如方解石、大理石、浮石、海泡石及白雲石，或是合成的無機及有機食物之顆粒，及有機物質例如鋸木屑、椰子殼、玉米軸及菸草莖之顆粒；合適的乳化劑及/或泡沫形成劑是：例如非離子性及陰離子性乳化劑例如聚氧乙烯脂肪酸酯、聚氧乙烯脂肪醇醚，例如烷基芳基聚甘醇醚、磺酸烷酯、硫酸烷酯、磺酸芳酯，或蛋白質水解物；合適的分散劑是：非離子及/或離子性物質，例

如從醇-POE 及/或-POP 醚類、酸及/或 POP-POE 酯類、烷基芳基及/或 POP-POE 醚類、脂肪及/或 POP-POE 加成物、POP-及/或 POP-多元醇衍生物、POE-及/或 POP-山梨糖醇酐或-糖加合物、硫酸烷酯或硫酸芳酯、磺酸烷酯或磺酸芳酯及磷酸烷酯或磷酸芳酯、或對應的 PO-醚加合物。其他合適的是寡-或聚合物，例如衍生自乙烯系單體、丙烯酸、EO 及/或 PO 本身或結合例如(聚)醇類或(聚)胺類。也可以使用木質素及其磺酸衍生物、未經改良及經改良的纖維素、芳族及/或脂族磺酸、及其與甲醛之加合物。

該活性物質可以轉化成慣用的調製物例如溶液、乳液、可溼化的粉劑、水-及油-基質的懸浮液、粉劑、灰劑、糊劑、可溶解的粉劑、可溶解的粒劑、用餘播撒的粒劑、懸浮乳液濃縮劑、浸透活性化合物之天然物質、浸透活性化合物之合成的物質、在聚合物質中的肥料及微囊化劑。

本發明之活性化合物可以如此使用、在其調製物之形式或從其製備之形式使用，例如即可使用的溶液、乳液、水-或油-基質的懸服液、粉末、可溼化的粉末、糊劑、可溶解的粉末、撒劑、可溶解的粒劑、供散播的粒劑、懸服液-乳液濃縮物、浸漬活性化合物之天然物質、浸漬活性化合物之合成物質、肥料及在聚合物質內的微膠。在慣用的方式下進行施加，例如經由倒注、噴灑、霧化、散佈、揮灑、泡沫化、噴塗等。還可以經由超低體積法施加活性化合物或將活性化合物製劑或活性化合物本身注射至土壤內。也可以處理植物之種子。

上述調製物可以在本身已知的方法製備，例如經由將活性化合物與至少一種慣用的延伸劑、溶劑或稀釋劑、乳化劑、分散劑及/或黏著劑或固定劑、溼化劑、去水劑、如果適當時的乾燥劑及 UV 安定劑及如果適當時的染劑及顏料、抗泡沫劑、防腐劑、次稠化劑、膠水、赤黴素及其他加工助劑混合。

根據本發明之組成物不只包括即可使用且可經由合適的裝置施加至植物或種子的調製物，還包括商業化的濃縮物其在使用前必須用水稀釋。

根據本發明之活性化合物可以是以本身存在或其(商業化的)調製物以及從這些調製物與其他(已知的)活性化合物例如殺昆蟲劑、誘引劑、消毒劑、殺菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑、殺真菌劑、生長調節劑、除草劑、肥料、安全劑及/或化學信息素製備成混合物之使用形式。

可以使用的輔劑是可使賦予組成物本身及/或從其衍生的製劑(例如噴霧混合物、種子敷料)有特定性質例如某些技術性質及/或特定生物性質之彼等物質。合適的典型輔劑是：延伸劑、溶劑及載劑。

合適的延伸劑是例如水、極性及非極性有機化學液體例如從芳族及非芳族烴類(例如烷屬烴、烷基苯、烷基萘、氯苯)、醇及多元醇類(其可隨意地經取代、醚化及/或酯化)、酮類(例如丙酮、環己酮)、酯類(包括脂肪及油類)及(聚)醚類、未經取代及經取代的胺類、鹽胺類、內鹽胺類(例如 N-烷基吡咯啶)及內酯類、砜及亞砜類(例如二甲亞砜)。

液化的氣體延伸劑或載劑是在環境溫度及大氣壓力下是氣體之液體，例如氣溶膠推動劑例如鹵化的烴類，以及丁烷、丙烷、氮氣及二氧化碳。

在調製物中可以使用稠化劑例如粉末、顆粒或膠乳形式之羧甲基纖維素、天然與合成的聚合物，例如阿拉伯膠、聚乙烯醇及聚醋酸乙烯酯，或者是天然磷脂例如腦磷脂及卵磷脂及合成的磷脂。其他可能的添加劑是礦物及植物油。

如果使用的延伸劑是水，也可以使用有機溶劑作為輔助溶劑。實質上合適的液體溶劑是：芳族化合物例如二甲苯、甲苯或烷基苯，氯化芳族化合物或氯化脂族烴類例如氯苯、氯乙烯或二氯甲烷，脂族烴類例如環己烷或鏈烷烴例如礦物油餾份、醇類例如丁醇或甘醇及其醚類及酯類，酮類例如丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮或環己酮，強極性溶劑例如二甲基甲醯胺及二甲亞砷及水。

根據本發明之組成物可以另外含有其他成份，例如表面活性劑。合適的表面活性劑是具有離子或非離子性質之乳化劑及/或泡沫形成劑、分散劑或溼化劑，或這些表面活性劑之混合物。這些的實例是聚丙烯酸之鹽類、木質磺酸之鹽類、酚磺酸或萘磺酸之鹽類、環氧乙烷與脂肪醇或與脂肪酸或與脂肪胺之聚縮合物、經取代的酚(較宜是烷基酚或芳基酚)、磺醯琥珀酸酯之鹽類、牛磺酸衍生物(較宜是牛磺酸烷酯)、聚乙氧基化的醇或酚之磷酸酯類、多元醇之脂肪酸酯類、及含有硫酸酯、磺酸酯及磷酸酯的化合物之衍生物，例如烷基芳基聚乙二醇醚類、磺酸烷酯、硫酸烷酯、

磺酸芳酯、蛋白質水解物、木質亞硫酸廢液及甲基纖維素。如果其中一種活性化合物及/或其中一種惰性載劑是不溶於水且在水中進行實施時，則需要存在表面活性劑。表面活性劑之比例是在 5 及 40 根據本發明組成物重量%之間。

可以使用染劑例如無機顏料例如氧化鐵、氧化鈦及普魯士藍，及有機染劑例如茜素藍染劑、偶氮染劑及金屬酞花青染劑，及微量營養劑例如鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬及鋅之鹽類。

其他可能的添加劑是香料、隨意經改良礦物或植物油、蠟及營養劑(包括微量營養劑)，例如鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬及鋅之鹽類。

也可以存在安定劑例如低溫安定劑、防腐劑、抗氧化劑、光安定劑或改良化學及/或物理安定性的其他藥劑。

如果適當時，也可能存在其他添加成份，例如保護性膠體、黏著劑、澆水、稠化劑、觸變劑、穿透劑、安定劑、螯合劑、複合物形成劑。通常，該活性化合物可以結合慣用於調製目的之任何固體或液體添加劑。

該調製物通常含有 0.05 及 99 重量%之間，0.01 及 98 重量%，較宜是 0.1 及 95 重量%之間，特別較宜是 0.5 及 90 重量%之間的活性化合物，非常特別較宜是 10 及 70 重量%之間。

上述調製物可以在根據本發明之方法中用於控制不要的微生物，其中是將根據本發明之二胺基嘧啶類施加至微

生物及/或其住所。

根據本發明之活性化合物本身或在其調製物中，也可以在與已知的殺真菌劑、殺菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑或殺昆蟲劑之混合物中使用，例如用於增廣活性範圍或預防產生抗藥性。

合適的混合夥伴是例如已知的殺真菌劑、殺昆蟲劑、殺蟎劑、殺線蟲劑或殺菌劑(也參見 Pesticide Manual, 13th ed.)。

也可能是與其他已知的活性化合物例如除草劑、或與肥料及生長調節劑、安全劑及/或化學信息素之混合物。

該化合物是在合適於使用形式之慣用方式下使用。

植物致病性有害真菌之控制主要是經由使用農作物保護組成物處理土壤及植物地面上的部份。由於考量農作物保護組成物可能對環境及人類與動物健康之衝擊，努力減低活性化合物之使用量。

本發明之活性化合物可以如此使用、在其調製物之形式或從其製備之形式使用，例如即可使用的溶液、懸服液、可溼化的粉末、糊劑、可溶解的粉末、撒劑及粒劑。在慣用的方式下進行施加，例如經由倒注、噴灑、霧化、散佈、揮灑、泡沫化、噴塗等。還可以經由超低體積法施加活性化合物或將活性化合物製劑或活性化合物本身注射至土壤內。也可以處理植物之種子。

當使用根據本發明之活性化合物作為殺真菌劑時，使用率可以在大範圍內變化，取決於應用的種類。根據本發

明之活性化合物之施加率是

- 在處理植物的部份例如葉子時：從 0.1 至 10000 克/公頃，較宜從 10 至 1000 克/公頃，尤其較宜從 50 至 300 克/公頃(當在經由倒注或浸漬應用時，使用率還可以再下降，尤其當使用惰性基質例如岩石纖維或珍珠岩時)；
- 在處理種子時：從 2 至 200 克每 100 公斤種子，較宜從 3 至 150 克每 100 公斤種子，尤其較宜從 2.5 至 25 克每 100 公斤種子，非常尤其較宜從 2.5 至 12.5 克每 100 公斤種子；
- 在土壤處理時：從 0.1 至 10000 克/公頃，較宜從 1 至 5000 克/公頃。

這些施加率只是提出作為實例且不能限制本發明之目的。

根據本發明之化合物也可以用於保護與海水或鹽水接觸之物件防止在物件上生長，例如船殼、屏、網、建築物、碼頭及訊號設備。

根據本發明之活性化合物本身或結合其他活性化合物，還可以作為除污劑使用。

根據本發明之處理方法可以用於處理基因改造的有機體(GMOs)，例如植物或種子。基因改造的植物(或基因轉殖的植物)是其中異種基因經穩定地整合至基因組中的植物。「異種基因」一詞實質上係指植物外部提供或組合的基因，且其經加入轉化的植物之核基因組、葉綠體基因組或線粒體後，因而賦予新穎或改良的農業經濟或其他性質，其表達一種有價值的蛋白質或多肽，或其向下調整或沈寂

存在於植物中的另一種基因或其他基因(例如經由反向基因鏈技術 (Antisense Technology)、共同壓制技術 (cosuppression technology)或 RNA 干擾-RNAi 技術)。存在於基因組的異種基因也係指轉殖基因。經由其特定存在於植物基因組所定義之基因轉殖，係指轉化事件或基因轉殖事件。

取決於植物種類或植物栽培、其處所及其生長情形(土壤、氣候、生長期、營養)，根據本發明之處理也可導致超加成(「協同增效」)效應。據此，例如可能有超越實際預期的效應之下列效應：減少施加率及/或擴大活性效應及/或增加可以根據本發明使用的活性物質及組成物之活性，較佳的植物生長、增加對高或低溫之耐受度、增加對乾旱或水或土壤鹽分之耐受度、增加開花表現、容易收成、加速成熟、更高的產量、較大的果實、較大的植物高度、強化葉子的綠色、容易開花、較佳的品質及/或收成產物有更高的營養價值、果實中有較高的糖濃度、收成產物有較佳的儲存能力及/或處理性。

在本發明之情形中，不要的植物致病性真菌及/或微生物及/或病毒係指植物致病性真菌、細菌及病毒。據此，根據本發明之物質可以用於保護植物在處理後的一段時間內免於受到上述病原體之攻擊。用該活性化合物處理植物後，保護的有效期間通常延伸從 1 至 10 天，較宜 1 至 7 天。

較宜根據本發明處理的植物及植物栽培變種包括含有基因物質其賦予這些植物特別有利、有價值的特質之全部植物(不論是經由培養及/或生物技術方式達成)。

也較宜根據本發明處理的植物及植物栽培變種是對於一或多種生存逆境有抵抗性者，也就是說該植物對於動物及微生物害蟲顯現較佳的防禦性，例如對抗線蟲、昆蟲、蟎、植物致病性真菌、細菌、病毒及/或類病毒。

也較宜根據本發明處理的植物及植物栽培變種是對於一或多種生存逆境因子有抵抗性之彼等植物。生存逆境條件包括例如乾旱、冷溫度暴露、熱暴露、逆滲透、洪水、增加的土壤鹽分、增加的礦物暴露、臭氧暴露、強光暴露、有限供應的氮養分、有限供應的磷養分、避開陰暗處。

也較宜根據本發明處理的植物及植物栽培變種是具有強化產量的特徵之彼等植物。在該植物增加產量可以是例如改良植物生理機能、成長及發育例如水使用效率、水滯留效率、改良氮使用、強化碳同化作用、改良光合成、增加發芽效率及加速成熟之結果。還可以經由改良植物構造(在逆境及非逆境條件下)而進一步影響產量，包括但不限於早開花、開花控制供混合種子製造、幼苗活力、植物大小、框際模式(intermode)及距離、根生長、種子大小、果實大小、豆莢大小、豆莢或穀穗數量、每個豆莢或穀穗之種子數量、種子生物量、強化的種子裝填、降低的種子分散、降低的豆莢開裂及寄宿反抗。其他產量特質包括種子組成物，例如碳水化合物含量、蛋白質含量、油含量及組成物、營養

值、降低抗營養的化合物、改良加工性及較佳的儲存安定性。

可以根據本發明處理的植物是雜交植物其已經表達雜種優勢或雜交活力之特徵，其通常導致較高的產量、活力、健康及對於生存及無生存逆境因子之抵抗性。此植物經由異種交配天生的雄性-無菌父系(雌性母系)與另一個雄性-無菌父系(雄性父系)而製成。雜交種子通常從雄性無菌植物獲取並販售至栽培者。雄性無菌植物有時可以(例如在農作物)經由摘去雄穗而生產，也就是機械移除雄性生殖器官(或雄花)，但是更典型的是雄性不育是植物基因組中基因決定因素的結果。在此情形中，且尤其是當種子是從雜交植物所要收穫的產物時，通常有用於確認雜交植物中的雄性生產力是完全恢復。此點可以經由確認雄性父系具有適當的生產力恢復基因其可以恢復含有與雄性不育有關的基因決定因素之雜交植物中的雄性生產力。雄性不育的基因決定因素可能位於細胞質中。細胞質雄性不育(CMS)的實例是例如揭示在芸苔屬植物(WO 1992/005251、WO 1995/009910、WO 1998/27806、WO 2005/002324、WO 2006/021972 及 US 6,229,072)。但是，雄性不育的基因決定因素也可能位於核基因組中。雄性不育的植物也可能得自植物生物科技方法例如基因工程。得到雄性不育植物的一種特別有用的方法是揭示在 WO 89/10396，其中例如一種核糖核酸酶例如轉核酸水解酶(barnase)是選擇性地表達在雄蕊之絨氈層細胞

內。不育症可以經由在絨氈層細胞內表達核糖核酸酶抑制劑例如巴司塔(barstar)而恢復。

可以根據本發明處理的植物及植物栽培變種(得自經由生物科技方法例如基因工程)是耐除草劑的植物，也就是使其耐受一或多種給定除草劑之植物。此植物可以得自基因轉化，或經由選擇含有突變而賦予此除草劑耐受性之植物。

耐除草劑的植物是例如耐嘉磷塞的植物，也就是使其耐受除草劑嘉磷塞或其鹽之植物。例如，耐嘉磷塞的植物可以經由用編碼酶5-烯醯丙酮酸莽草酸 3-磷酸鹽合成酶(EPSPS)的基因轉化植物而獲得。此 EPSPS 基因之實例是細菌傷寒沙門氏菌之 AroA 基因(突變體 CT7)、細菌農桿菌屬之 CP4 基因、編碼 Petunia EPSPS 之基因、番茄基因或牛筋草 EPSPS。其也可以是突變的 EPSPS。耐嘉磷塞的植物也可以經由表達編碼嘉磷塞氧化還原酶的基因而獲得。耐嘉磷塞的植物也可以經由表達編碼嘉磷塞乙醯基轉殖酶的基因而獲得。耐嘉磷塞的植物也可以經由選擇含有上述基因之自然發生的突變而獲得。

其他耐除草劑的植物是例如抑制麩胺醯胺合成酶而耐受除草劑例如畢拉草(bialaphos)、草銨磷(phosphinotricin)或固殺草(glufosinate)之植物。此種植物可已經由表達解毒除草劑的酶或對抑制作用有抵抗性的突變穀氨醯胺合成酶而獲得。一種此有效的解毒酶是編碼磷絲菌素 N-乙醯轉

殖酶(例如從鏈黴菌種之棒狀或小塊蛋白質)的酶。表達外生磷絲菌素 N-乙醯轉殖酶的植物經揭示。

其他耐除草劑的植物也是使其對於抑制羥基苯基丙酮酸酯二氧酶(HPPD)的殺蟲劑有耐受性之植物，羥基苯基丙酮酸酯二氧酶是催化其中對-羥基苯基丙酮酸酯(HPP)轉化成黑尿酸(homogentisate)的反應之酶。耐受 HPPD-抑制劑的植物可以用編碼天然產生的耐 HPPD 酶之基因、或編碼突變的 HPPD 酶之基因轉化。儘管經由 HPPD-抑制劑抑制本土 HPPD 酶，對於 HPPD-抑制劑之耐受性也可以經由用編碼某些可以形成黑尿素的基因而獲得。植物對於 HPPD-抑制劑之耐受性也可以除了用耐受 HPPD 的酶之外，經由用編碼預苯酸脫水酶轉化而改良。

再其他耐除草劑的植物是使其耐乙醯乳酸合成酶(ALS)抑制劑之植物。已知的 ALS-抑制劑包括例如磺醯基脲、咪唑啉酮、三唑嘧啶、嘧啶氧基(硫)苯甲酸酯及/或磺醯基胺基羧基三唑啉酮除草劑。在 ALS 酶(也稱為乙醯羥基酸合成酶, AHAS)之不同突變物已知賦予耐受不同的除草劑及除草劑群組。耐受磺醯基脲的植物及耐受咪唑啉酮的植物之生產是揭示在 WO 1996/033270。其他耐受磺醯基脲及咪唑啉酮的植物也揭示在例如 WO 2007/024782。

耐受咪唑啉酮及/或磺醯基脲的其他植物可以在除草劑或突變育種存在下在細胞培養中選擇經由引發突變發生而獲得。

也可以根據本發明處理的植物或植物栽培變種(經由生物科技方法例如基因工程而獲得)是抵抗昆蟲的基因轉殖植物，也就是抵抗某些標靶昆蟲攻擊的植物。此種植物可以經由基因轉化而獲得、或經由選擇含有賦予此抵抗昆蟲的突變之植物。

本文中使用的「抵抗昆蟲的基因轉殖植物」包括含有至少一種含有下面編碼序列的轉殖基因之任何植物：

- 1) 從蘇雲金芽孢桿菌之殺昆蟲性結晶蛋白質或其殺昆蟲性部份，例如上網列在
http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/
 之殺昆蟲性結晶蛋白質或其殺昆蟲性部份，例如 Cry 蛋白質類 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry2Ab、Cry3Ae 或 Cry3Bb 或其殺昆蟲性部份之蛋白質；或
- 2) 從蘇雲金芽孢桿菌之結晶蛋白質或其蛋白質部份，其在從蘇雲金芽孢桿菌之第二種其他蛋白質或其蛋白質部份存在下是有殺昆蟲性，例如 Cy34 及 Cy35 結晶蛋白質製成的二元毒素；或
- 3) 含有從蘇雲金芽孢桿菌之殺昆蟲性結晶蛋白質之部份之混合殺昆蟲性蛋白質，例如上述 1) 的蛋白質之混合物或上述 2) 的蛋白質之混合物，例如經由玉米事件 MON98034 (WO 2007/027777) 生產的 Cry1A.105 蛋白質；或
- 4) 上述 1) 至 3) 任何其中一種蛋白質，其中部份，尤其是 1 至 10 個胺基酸被其他胺基酸取代而得到對標靶昆蟲物種

具有較大的殺昆蟲活性，及/或擴大影響的標靶昆蟲物種之範圍，及/或因為在複製或轉化過程中將電荷加入編碼的 DNA 中，例如在玉米事件 MON863 或 MON88017 中的 Cry3Bb1 蛋白質，或在玉米事件 Cry3Bb1 中的 Cry3A 蛋白質；或

- 5) 從蘇雲金芽孢桿菌或蠟狀芽孢桿菌分泌的殺昆蟲性蛋白質或其殺昆蟲性部份，例如下列植物性殺昆蟲劑(VIP)：
http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html，例如從 VIP3Aa 蛋白質類的蛋白質；或
- 6) 從蘇雲金芽孢桿菌或蠟狀芽孢桿菌分泌的蛋白質其在從蘇雲金芽孢桿菌或蘇雲金芽孢桿菌分泌的第二種蛋白質存在下是殺蟲劑，例如 VIP1A 及 VIP2A 製造的二元毒素；或
- 7) 含有從蘇雲金芽孢桿菌或蠟狀芽孢桿菌分泌的不同蛋白質的部份之混合殺昆蟲性蛋白質，例如上述 1) 的蛋白質之混合物或上述 2) 的蛋白質之混合物；或
- 8) 上述 1) 至 3) 任何其中一種蛋白質，其中部份，尤其是 1 至 10 個胺基酸被其他胺基酸取代而得到對標靶昆蟲物種具有較大的殺昆蟲活性，及/或擴大影響的標靶昆蟲物種之範圍，及/或因為在複製或轉化過程中將電荷加入編碼的 DNA 中(同時仍然編碼一種殺昆蟲性蛋白質)，例如在玉米事件 COT102 中的 VIP3Aa 蛋白質。

當然，在本文中使用的抵抗昆蟲之轉殖基因植物，也

包括含有編碼上述 1 至 8 類任何一種蛋白質的基因組合之任何植物。在一個具體實施例中，抵抗昆蟲之植物含有一種以上編碼上述 1 至 8 類任何一種蛋白質的基因組，當使用針對不同標靶昆蟲物種之不同蛋白質時擴大影響標靶昆蟲物種之範圍，或經由使用不同的蛋白質殺昆蟲劑至相同的標靶昆蟲物種但是有不同的作用模式，例如結合至昆蟲中的不同受體位置，用於延遲植物發展昆蟲抵抗性。

也可以根據本發明處理的植物或植物栽培變種(經由植物生物科技方法例如基因工程而獲得)是耐受生存逆境因子的植物。此種植物可以經由基因轉化而獲得、或經由選擇含有賦予此抵抗逆境的突變之植物。特別有價值的逆境耐受植物包括：

- a. 含有可以減少聚(ADP-核糖)聚合酶(PARP)基因在植物細胞或植物中表達及/或活性的轉殖基因之植物；
- b. 含有可以減少植物或植物細胞的 PARC 編碼基因之表達及/或活性之強化逆境耐受的轉殖基因之植物；
- c. 含有編碼菸鹼醯胺腺嘌呤二核苷酸救助生物合成通道的植物功能酶之強化逆境耐受轉殖基因包括菸鹼醯胺酶、菸酸磷酸核糖轉移酶、菸鹼酸單腺苷酸轉移酶、菸鹼醯胺腺嘌呤二核苷酸合成酶或菸鹼醯胺磷酸核糖轉移酶之植物。

也可以根據本發明處理的植物或植物栽培變種(經由植物生物科技方法例如基因工程而獲得)顯現改變的品質、收穫產物之品質及/或儲存安定性及/或改變收穫產物的特

定成份之品質，例如

1) 合成改良的澱粉之轉殖基因植物，在其物理-化學特徵中，尤其是澱粉酶含量或澱粉酶/支鏈膠澱粉比例、支鏈化的程度、平均鏈長、支鏈分布、黏度行為、膠強度、澱粉粒大小及/或澱粉粒形態，與野生種植物細胞或植物中的合成澱粉比較都經改變，所以其較合適於特定的用途。

2) 合成非澱粉碳水化合物聚合物或其合成與沒有基因改良的野生種植物比較之具有改變的性質之非澱粉碳水化合物聚合物之轉殖基因植物。實例是生產多果糖尤其是菊芋多醣及果聚糖之植物、生產 α -1,4-葡聚糖之植物及生產 α -1,6 支鏈的 α -1,4-葡聚糖之植物。

3) 生產玻尿酸之轉殖基因植物。

也可以根據本發明處理的植物或植物栽培變種(經由植物生物科技方法例如基因工程而獲得)是例如具有改變纖維特徵的棉花植物。此種植物可以經由基因轉化或經由選擇賦予此改變的纖維特徵之突變而獲得，並包括：

a) 植物，例如棉花植物，其含有改變形式之纖維素合成酶基因；

b) 植物，例如棉花植物，其含有改變形式的 rsw2 或 rsw3 之同系核酸；

c) 植物，例如棉花植物，其增加蔗糖磷酸合成酶之表達；

d) 植物，例如棉花植物，其增加蔗糖合成酶之表達；

e) 植物，例如棉花植物，其中改變以纖維細胞為基質

的胞間連絲開門之時機，例如經由向下調節纖維選擇性 β -1,3-葡聚糖酶；

f) 植物，例如棉花植物，其具有改變反應爭纖維，例如經由 N-乙醯基葡糖胺轉移酶基因包括 nodC 及幾丁質基因之表達。

也可以根據本發明處理的植物或植物栽培變種(經由植物生物科技方法例如基因工程而獲得)是例如具有改變的油特徵之油菜籽或相關的芸苔屬植物。此種植物可以經由基因轉化或經由選擇含有賦予此改變的油特徵的突變之植物而獲得並包括：

a) 植物，例如油菜籽植物，其生產具有高油酸含量之油；

b) 植物，例如油菜籽植物，其生產具有低亞麻酸含量之油；

c) 植物，例如油菜籽植物，其生產具有低飽和脂肪酸含量之油。

可以根據本發明處理的特別有價值之轉殖基因植物是含有一或多種編碼一或多種毒素的基因之植物，其是在下面的商標名稱販賣的轉殖基因植物：YIELD GARD® (例如玉米、棉花、大豆)、KnockOut® (例如玉米)、BiteGard® (例如玉米)、BT-Xtra® (例如玉米)、StarLink® (例如玉米)、Bollgard® (棉花)、Nucoton® (棉花)、Nucotn 33B® (棉花)、NatureGard® (例如玉米)、Protecta®及 NewLeaf® (馬鈴薯)。可以舉例的耐除草劑的植物之實例是玉米變種、棉花

變種及大豆變種其系在下面的商標名稱販賣：Roundup Ready® (耐嘉磷塞，例如玉米、棉花、大豆)、Liberty Link® (耐磷絲菌素，例如油菜籽)、IMI® (耐咪唑啉酮)及 SCS® (耐磺醯基脲，例如玉米)。可以舉例之耐除草劑的植物(在傳統方式下種植具有耐除草劑的植物)包括以 Clearfield® 之名稱販賣的變種(例如玉米)。

可以根據本發明處理的特別有價值之轉殖基因植物是含有轉化事件或轉化事件組合之植物，其實例是例如在多個國家或地區當局之資料庫中(見例如 http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx 及 <http://www.agbios.com/dbase.php>)。

根據本發明，列出的植物可以特別有利地使用根據本發明通式(I)之化合物或活性化合物混合物處理。上述對於活性物質組合物之較佳範圍也適用於這些植物之處理，特別強調的是用本文中明確提出的活性物質組合物處理植物。

根據本發明之組成物或活性化合物也可以用於保護植物經一段時間，處理後可以防止遭受上述病原體之攻擊。使用活性化合物處理植物後，提供的保護時期通常是延伸到 1 至 28 天，較宜 1 至 14 天，尤其較宜 1 至 10 天，非常尤其較宜 1 至 7 天，或種子經處理後至多達 200 天。

根據本發明式(I)之活性化合物之製備及用途是列在下面的實例中。但是，本發明不受限於這些實例。

【實施方式】

製備式(V)之起始物質：

2,5-二氯-N-(3-甲氧基丙-2-基)嘧啶-4-胺(V-1)

在-10°C，將 5.42 克(39.3 毫莫耳)的碳酸鉀添加至 6.00 克(32.7 毫莫耳)的 2,4,5-三氯嘧啶在 100 毫升乙腈的溶液中。然後逐滴加入 3.06 克(34.4 毫莫耳)的 2-胺基-1-甲氧基丙烷在乙腈中的 20%強度溶液。攪拌並使反應混合物溫熱至室溫。經 16 小時後，將反應混合物攪拌至 250 毫升的冰水/稀鹽酸(1:1)中。將形成的沈澱物過濾並乾燥。如此得到 5.10 克(64%)的 2,5-二氯-N-(3-甲氧基丙-2-基)嘧啶-4-胺(V-1) (logP (pH 2.3): 2.10)。¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 8.02 (s, 1 H), 6.03 (br. s, 1 H), 4.39 – 4.33 (m, 1 H), 3.48 – 3.40 (m, 2 H), 3.33 (s., 3 H), 1.23 (d, 3 H)。

下面化合物可以在類似的方法下製備：

5-溴-2-氯-N-(3-甲氧基丙-2-基)嘧啶-4-胺(V-2) (logP (pH 2.3): 2.26)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.22 (s, 1 H), 6.98 (br. d, 1 H), 4.36 (br. m, 1 H), 3.48 (dd, 1 H), 3.36 (dd, 1 H), 3.28 (s, 1 H), 1.17 (d, 3 H)。

2,5-二氯-N-(2-甲氧基乙基)嘧啶-4-胺(V-3) (logP (pH 2.3): 1.65)。¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 8.02 (s, 1 H), 6.23 (br. s, 1 H), 3.63 – 3.59 (m, 2 H), 3.55 – 3.5 (m, 2 H), 3.33 (s, 3 H)。

2,5-二氯-N-(1-羥基丁-2-基)嘧啶-4-胺(V-4) (logP (pH 2.3): 1.65)。¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 8.02 (s, 1 H), 5.99 (br. s, 1 H), 4.14 – 4.06 (m, 1 H), 3.62 – 3.59 (m, 2 H), 2.83 –

2.80 (m, 1 H), 1.72 – 1.54 (m, 2 H), 0.94 – 0.91 (m, 3H)。

2,5-二氯-N-(2-羥基乙基)嘧啶-4-胺(V-5) (logP (pH 2.3): 0.97)。¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 8.02 (s, 1 H), 6.32 (br. s, 1 H), 3.69 – 3.66 (m, 2 H), 3.57 – 3.53 (m, 2 H)。

2,5-二氯-N-[1-(甲基胺磺基)丙-2-基]嘧啶-4-胺(V-6) (logP (pH 2.3): 2.73)。¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 8.03 (s, 1 H), 6.07 (br. s, 1 H), 4.42 – 4.35 (m, 1 H), 2.79 – 2.66 (m, 2 H), 2.12 (s, 3 H), 1.32 (d, 3 H)。

2,5-二氯-N-[2-甲基-1-(甲基胺磺基)丙-2-基]嘧啶-4-胺(V-7) (logP (pH 2.3): 3.47)。¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 8.03 (s, 1 H), 5.89 (br. s, 1 H), 3.09 (s, 2 H), 2.09 (s, 3 H), 1.53 (s, 6 H)。

[(2,5-二氯嘧啶-4-基)胺基]乙腈(V-8) (logP (pH 2.3): 1.27)。¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 8.16 (s, 1 H), 6.70 (br. s, 1 H), 4.35 (d, 2 H)。

2,5-二氯-N-(丙-2-基)嘧啶-4-胺(V-9) (logP (pH 2.3): 2.46)。¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 7.99 (s, 1 H), 5.92 (br. s, 1 H), 4.31 – 4.23 (m, 1 H), 1.25 (d, 6 H)。

5-溴-2-氯-N-(丙-2-基)嘧啶-4-胺(V-10) (logP (pH 2.3): 2.62)。¹H NMR (400 MHz, 乙腈-d) δ = 8.19 (s, 1H), 7.03 (br. s, 1H), 4.25 (br. m, 1H), 1.22 (d, 6H)。

2,5-二氯-N-甲基-N-(丙-2-基)嘧啶-4-胺(V-11) (logP (pH 2.3): 3.16)。¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 8.04 (s, 1 H), 4.82 – 4.76 (m, 1 H), 3.03 (s., 3 H), 1.22 (d, 6 H)。

2,5-二氯-N-(環戊基)嘧啶-4-胺(V-12) (logP (pH 2.3):

3.16)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.11- 8.09 (d, 1 H), 7.36 (d, 1 H), 4.36-4.28 (m, 1 H), 1.98-1.93 (m, 2 H), 1.73-1.67 (m, 2 H), 1.64-1.53 (m, 4H)。

2,5-二氯-N-(丙-2-烯-1-基)嘧啶-4-胺(V-13) (logP (pH 2.3):

2.12)。¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 8.03 (s, 1 H), 6.40 (br. s, 1 H), 5.98 – 5.88 (m, 1 H), 5.23 – 5.12 (m, 2 H), 4.09 – 4.06 (m, 2 H)。

2,5-二氯-N-(丁-2-基)嘧啶-4-胺(V-14) (logP (pH 2.3):

2.94)。¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 7.99 (s, 1 H), 5.90 (br. s, 1 H), 4.15 – 4.08 (m, 1 H), 1.67 – 1.56 (m, 2 H), 1.21 (d, 3 H), 0.91 (t, 3 H)。

N-(丁-2-基)-2,5-二氯-N-甲基嘧啶-4-胺(V-15) (logP (pH 2.3):

3.62)。¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 8.04 (s, 1 H), 4.62 – 4.56 (m, 1 H), 3.01 (s, 3 H), 1.70 – 1.52 (m, 2H), 1.21 (d, 3 H), 0.84 (t, 3H)。

N-(丁-1-基)-2,5-二氯嘧啶-4-胺(V-16) (logP (pH 2.3): 2.91).

¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 7.99 (s, 1 H), 6.23 (br. s, 1 H), 3.47 – 3.42 (m, 2 H), 1.63 – 1.56 (m, 2 H), 1.42 – 1.33 (m, 2 H), 0.92 (t, 3 H)。

N-第三丁基-2,5-二氯嘧啶-4-胺(V-17) (logP (pH 2.3):

3.22)。¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 8.00 (s, 1 H), 5.73 (br. s, 1 H), 1.48 (s, 9 H)。

2,5-二氯-N-環己基嘧啶-4-胺(V-18) (logP (pH 2.3): 3.47)。¹H

NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 7.99 (s, 1 H), 5.91 (br. s, 1 H), 3.99 – 3.91 (m, 1 H), 1.79 – 1.20 (m, 10 H)。

2,5-二氯-N-乙基-N-甲基嘧啶-4-胺(V-19) (logP (pH 2.3): 2.68)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.14 (s, 1 H), 3.67 (q, 2 H), 3.18 (s, 3 H), 1.19 (t, 3 H)。

2,5-二氯-N-乙基嘧啶-4-胺(V-20) (logP (pH 2.3): 1.93)。¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 7.99 (s, 1 H), 6.23 (br. s, 1 H), 3.48 (q, 2 H), 1.20 (t, 3 H)。

2,5-二氯-N-丙基嘧啶-4-胺(V-21): logP (pH 2.3): 2.42)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.14 (s, 1 H), 7.94 (br. s, 1 H), 3.30 (t, 2 H), 1.58 – 1.53 (m, 2 H), 0.87 (t, 3 H)。

2,5-二氯-N-(3-甲基丁基)嘧啶-4-胺(V-22): logP (pH 2.3): 3.45)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.08 (s, 1 H), 7.67 (br. s, 1 H), 3.42 – 3.37 (m, 2 H), 1.63 – 1.56 (m, 1 H), 1.49 – 1.44 (m, 2 H), 0.89 (d, 6 H)。

2,5-二氯-N-(2-乙基丙基)嘧啶-4-胺(V-23): logP (pH 2.3): 3.39)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.09 (s, 1 H), 7.17 (br. s, 1 H), 3.99 – 3.93 (m, 1 H), 1.62 – 1.54 (m, 4 H), 0.84 (t, 6 H)。

2,5-二氯-N-(2-甲基丁基)嘧啶-4-胺(V-24): logP (pH 2.3): 3.42)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.09 (s, 1 H), 7.63 (br. s, 1 H), 3.35 – 3.29 (m, 1 H), 3.23 – 3.11 (m, 1 H), 1.77 – 1.73 (m, 1 H), 1.41 – 1.35 (m, 1 H), 1.17 – 1.10 (m, 1 H), 0.90 – 0.85 (m, 6 H)。

2,5-二氯-N-甲基-N-丙基嘧啶-4-胺(V-25): logP (pH 2.3):

3.31)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.14 (s, 1 H), 3.61 (t, 2 H), 3.22 (s, 3 H), 1.69 – 1.60 (m, 2 H), 0.87 (t, 3 H)。

2,5-二氯-N-甲基-N-(2-甲基丙基)嘧啶-4-胺(V-26): logP (pH

2.3): 3.78)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.14 (s, 1 H), 3.55 (d, 2 H), 3.23 (s, 3 H), 2.07 – 2.00 (m, 1 H), 0.86 (d, 6 H)。

2,5-二氯-N-(戊-2-基)嘧啶-4-胺(V-27): logP (pH 2.3):

3.47)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.09 (s, 1 H), 7.26 (br.s, 1 H), 4.22 – 4.14 (m, 1 H), 1.67 – 1.58 (m, 1 H), 1.52 – 1.44 (m, 1 H), 1.34 – 1.18 (m, 2 H), 1.12 (d, 3 H), 0.88 (t, 3 H)。

2,5-二氯-N-甲基-N-丙基嘧啶-4-胺(V-28): logP (pH 2.3):

3.89)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.13 (s, 1 H), 3.64 (t, 2 H), 3.20 (s, 3 H), 1.64 – 1.57 (m, 2 H), 1.35 – 1.29 (m, 2 H), 0.90 (t, 3 H)。

2,5-二氯-N-(2-甲基丙基)嘧啶-4-胺(V-29): logP (pH 2.3):

2.93)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.10 (s, 1 H), 7.66 (br.s, 1 H), 3.21 (t, 2 H), 1.99 – 1.92 (m, 1 H), 0.88 (d, 6 H)。

2,5-二氯-N-乙基-N-異丙基嘧啶-4-胺(V-30): logP (pH 2.3):

3.80)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.16 (s, 1 H), 4.77 – 4.70 (m, 1 H), 3.58 (q, 2 H), 1.23 (d, 6 H), 1.14 (t, 3 H)。

2,5-二氯-N-(pentyl)嘧啶-4-胺(V-31): logP (pH 2.3): 3.51)。

¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.08 (s, 1 H), 7.67 (br.s, 1

H), 3.39 – 3.34 (m, 2 H), 1.61 – 1.54 (m, 2 H), 1.36 – 1.24 (m, 4 H), 0.88 (t, 3 H)。

2,5-二氯-N-(2,2-二甲基丙基)嘧啶-4-胺(V-32): logP (pH 2.3): 3.44)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.12 (s, 1 H), 7.39 (br.s, 1 H), 3.28 (d, 2 H), 0.90 (s, 9 H)。

2,5-二氯-N-甲基-N-(丙-2-烯-1-基)嘧啶-4-胺(V-33) (logP (pH 2.3). 2.98)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.22 (s, 1 H), 5.93 – 5.85 (m, 1 H), 5.23 – 5.20 (m, 2 H), 4.27 – 4.25 (m, 2 H), 3.15 (s, 3 H)。

2-氯-N-(3-甲氧基丙-2-基)-5-三氟甲基嘧啶-4-胺(V-34)

在-10°C，將 1.91 克(13.8 毫莫耳)的碳酸鉀添加至 2.00 克(9.22 毫莫耳)的 2,4-二氯-5-(三氟甲基)嘧啶在 80 毫升乙腈的溶液中。然後逐滴加入 0.86 克(9.68 毫莫耳)的 2-胺基-1-甲氧基丙烷在乙腈中的 30%強度溶液。攪拌並使反應混合物溫熱至室溫。經 16 小時後，將反應混合物攪拌至 250 毫升的冰水中並用二氯甲烷(3x 100 毫升)萃取。將合併的有機層分離，用水(2x 100 毫升)清洗，經由 MgSO₄ 乾燥並在減壓下將溶劑去除。將粗產物在矽膠上經由管柱層析法純化(環己烷/醋酸乙酯)。如此得到 0.75 克(26%)的 2-氯-N-(3-甲氧基丙-2-基)-5-三氟甲基嘧啶-4-胺(V-21) (logP (pH 2.3): 2.75)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.28 (s, 1H), 3.56-3.52 (m, 3 H), 3.33-3.32 (d, 3 H), 1.24-1.22 (q, 3 H)。

製備式(IV)之化合物

N-乙基-N-甲基-1-(3-硝基苯基)甲磺醯胺(IV-1)

在 5°C, 將 5.00 克(84.8 毫莫耳)的乙基甲胺在醋酸乙酯中的 40%強度溶液逐滴添加至 5.00 克(21.2 毫莫耳)的(3-硝基苯基)甲磺醯氯在 100 毫升醋酸乙酯的溶液中歷時 30 分鐘。然後將反應在 60°C 攪拌 3 小時。冷卻後, 將反應混合物攪拌至 250 毫升的冰水/稀鹽酸(1:1)中並用醋酸乙酯(2 x 100 毫升)萃取。將合併的有機層用 100 毫升水清洗, 經由 MgSO₄ 乾燥並在減壓下將溶劑去除。如此得到 5.03 克(90%)所要的產物(logP (pH 2.3): 2.05). ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.29 (s, 1 H), 8.20 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.68 (dd, 1H), 4.57 (s, 2 H), 3.11 (q, 2 H), 2.71 (s, 3 H), 1.05 (t, 3 H)。

下面化合物可以在類似的方法下製備：

N-甲基-N-(丙-2-基)-1-(3-硝基苯基)甲磺醯胺(IV-2) (logP (pH 2.3): 2.35)。 ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.29 (s, 1 H), 8.20 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.67 (dd, 1H), 4.55 (s, 2 H), 3.93 (m, 1 H), 2.63 (s, 3 H), 1.05 (d, 6 H)。

N-(1-苯基乙基)-1-(3-硝基苯基)甲磺醯胺(IV-3) logP (pH 2.3): 2.63)。 ¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 8.18 (d, 1 H), 8.06 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.55 (dd, 1H), 7.39 – 7.27 (m, 5H) 5.83 (d, 1 H), 4.52 (m, 1 H), 4.21 (m, 2 H), 1.43 (d, 3 H)。

N-(苄基)-1-(3-硝基苯基)甲磺醯胺(IV-4) logP (pH 2.3): 2.43)。 ¹H NMR (400 MHz, MeCN-d) δ = 8.19 (d, 1 H), 8.17 (s, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.61 (dd, 1H), 7.37 – 7.26 (m, 5H) 4.35 (s, 2 H), 4.19 (d, 2 H)。

1-(3-胺基苯基)-N-乙基-N-甲基甲磺醯胺(IV-5):

在高壓鍋內，將 4.50 克(17.4 毫莫耳)的 N-乙基-N-甲基-1-(3-硝基苯基)甲磺醯胺及 1 克的 Pd/C (10%)先填入 100 毫升的甲醇中，並在 30°C 施加 5 巴的壓力。經 10 小時後，將觸媒過濾並將過濾液在減壓下濃縮。如此得到 3.45 克 (87%) of the 所要的產物(logP (pH 2.3): 0.71). ^1H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 6.98 (dd, 1 H), 6.60 (s, 1H), 6.55 – 6.51 (m, 2H), 4.93 (br. s, 2H), 4.13 (s, 2 H), 3.04 (q, 2H), 2.68 (s, 3H), 1.03 (t, 3 H)。

下面化合物可以在類似的方法下製備：

1-(3-胺基苯基)-N-甲基-N-(丙-2-基)甲磺醯胺(IV-6) (logP (pH 2.3): 1.08). ^1H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 6.98 (dd, 1 H), 6.59 (s, 1H), 6.53 – 6.50 (m, 2H), 5.01 (br. s, 2H), 4.14 (s, 2 H), 3.90 (m, 1H), 2.59 (s, 3H), 1.02 (d, 6 H)。

1-(3-胺基苯基)-N-(1-苯基乙基)甲磺醯胺(IV-7) (logP (pH 2.3): 1.53)。 ^1H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 7.42 – 7.21 (m, 6H) 6.93 (dd, 1 H), 6.53 – 6.49 (m, 2H), 6.38 (d, 1H), 4.86 (br. s, 2H), 4.43 (m, 1 H), 3.94 – 3.84 (m, 2H), 1.37 (d, 3 H)。

1-(3-胺基苯基)-N-苄基甲磺醯胺(IV-8) (logP (pH 2.3): 1.32)。 ^1H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 7.38 – 7.22 (m, 6H) 6.98 (dd, 1 H), 6.58 (s, 1H), 6.55 (d, 1H), 6.49 (d, 1H), 4.91 (br. s, 2H), 4.08 (s, 2 H), 4.06 (d, 2H)。

N-(3-胺基苯基)-N-甲基丙磺醯胺(IV-9) (logP (pH 2.3): 0.63)。 ^1H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 7.04 (dd, 1H) 6.53 (dd, 1

H), 6.44 (dd, 1H), 6.36 (dd, 1H), 5.07 (br.s, 2 H), 3.08 (s, 3 H), 2.06 (q, 2H), 0.93 (t, 3H)。

1-(3-胺基苄基)-3-甲基咪唑啉-2-酮(IV-10)

在 0°C，將 0.96 克(24.1 毫莫耳)的氫化鈉(60%在石蠟中)每次少量添加至 2.04 克(20.4 毫莫耳)的 1-甲基咪唑啉-2-酮在 50 毫升四氫呋喃的溶液中，並將反應混合物攪拌 30 分鐘。將 4.00 克(18.5 毫莫耳)的 3-硝基苄基溴在四氫呋喃中的溶液逐滴添加至此溶液中，並使混合物溫熱至室溫。經 3 小時後，將反應混合物攪拌至 250 毫升的冰水/稀鹽酸(1:1)中並用醋酸乙酯(2 x 100 毫升)萃取。將合併的有機層用 100 毫升的水清洗，經由 MgSO₄ 乾燥，經由矽膠過濾並在減壓下將溶劑去除。如此得到 3.56 克(81%)的 1-甲基-3-(3-硝基苄基)咪唑啉-2-酮(logP (pH 2.3): 2.03)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 8.12 (d, 1 H), 8.07 (s, 1H), 7.70 (d, 1H), 7.63 (dd, 1H), 4.40 (s, 2 H), 3.30 – 3.18 (m, 4 H), 2.70 (s, 3 H)，其先填入含有 1 克的 Pd/C (10%)在 100 毫升甲醇之高壓鍋內並在 30°C 施加 5 巴之壓力。經 10 小時後，將觸媒過濾並將過濾液在減壓下濃縮。如此得到 2.20 克(78%)的 1-(3-胺基苄基)-3-甲基咪唑啉-2-酮(IV-5) (logP (pH 2.3): 0.08)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 6.95 (dd, 1 H), 6.46 (d, 1H), 6.44 (s, 1H), 6.36 (d, 1H), 4.85 (br.s, 2 H), 4.09 (s, 2H), 3.23 – 3.09 (m, 4 H), 2.67 (s, 3 H)。

製備通式(I)、(Ia)、(Ib)及(Ic)之化合物

根據圖式 2 之方法 A：

4-({5-氯-4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺基]嘧啶-2-基}胺基)苯羧酸甲酯鹽酸鹽(化合物 38)

在室溫下，將 410 微升的 HCl 在二噁烷中的 4 M 溶液添加至 250 毫克(1.06 毫莫耳)的 2,5-二氯-N-(1-甲氧基丙-2-基)嘧啶-4-胺及 352 毫克(2.33 毫莫耳)的 4-胺基苯甲酸甲酯在 10 毫升乙腈的溶液中，並將混合物在 85°C 加熱。經 18 小時後，將熱的反應混合物過濾並使過濾液冷卻並攪拌。將從過濾液沈澱的產物過濾並乾燥。如此得到 282 毫克(71%)所要的產物(logP (pH 2.3): 2.31)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 9.60 (br. s, 1H), 8.02 (s, 1 H), 7.86 – 7.81 (m, 4H), 6.76 (d, 1H), 4.45 - 4.42 (m, 1H), 3.81 (s, 3 H), 3.54 – 3.50 (m, 2 H), 3.41 – 3.38 (m, 2H), 1.22 (d, 3 H)。

根據圖式 2 之方法 B：

4-({5-氯-4-[(1-甲氧基丙-2-基)胺基]嘧啶-2-基}胺基)-N,N-二甲基苯磺醯胺(化合物 16)

將 144 毫克(0.72 毫莫耳)的 2,5-二氯-N-(1-甲氧基丙-2-基)嘧啶-4-胺、141 毫克(0.69 毫莫耳)的 4-胺基-N,N-二甲基苯磺醯胺及 97 毫克(0.51 毫莫耳)的 4-甲苯磺酸在 10 毫升二噁烷中的混合物在 105°C 攪拌 18 小時。冷卻後，將反應在減壓下濃縮並將殘留物溶解在 50 毫升的醋酸乙酯中。將有機層用 10 毫升的飽和 NaHCO₃ 水溶液清洗後用 10 毫升的水清洗，經由 MgSO₄ 乾燥並在減壓下將溶劑去除。如此得到 99 毫克所要的產物(logP (pH 2.3): 2.25)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 10.53 (br. s, 1H), 8.19 (s, 1 H), 7.91 (d,

2H), 7.75 (br. s, 1H), 7.69 (d, 2H), 4.48 - 4.46 (m, 1H), 3.55 - 3.52 (m, 1 H), 3.40 - 3.37 (m, 1 H), 3.26 (s, 3H), 2.59 (s, 6 H), 1.22 (d, 3 H)。

根據圖式 3 製備式(VII)之起始物質：

2-苯胺基-5-氯嘧啶-4(3H)-酮(VII-1)

將含有 3.27 毫升的 1 M NaOH 水溶液 及 1 毫升 水之溶液添加至 500 毫克(2.73 毫莫耳)的 2,4,5-三氯嘧啶在 10 毫升二噁烷的溶液中。在室溫下攪拌 4 天後，將反應混合物在減壓下濃縮。將殘留物溶解在 50 毫升醋酸乙酯中並用 1 N HCl (aq)中和化。將有機層分離後用 10 毫升水清洗，經由 MgSO_4 乾燥並在減壓下將溶劑去除。將粗產物與 424 毫克(4.55 毫莫耳) 的苯胺及 532 毫克(3.09 毫莫耳)的 4-甲苯磺酸一起溶解在 10 毫升二噁烷中並在 105°C 加熱並攪拌。經 18 小時後，將反應混合物在減壓下濃縮並將殘留物溶解在 50 毫升醋酸乙酯中。將有機層用 10 毫升飽和的 NaHCO_3 水溶液清洗後用 10 毫升水清洗，經由 MgSO_4 乾燥並在減壓下將溶劑去除。如此得到 1000 毫克的 2-苯胺基-5-氯嘧啶-4(3H)-酮(VII-1) 其不再有任何進一步的純化而直接再反應($\log P$ (pH 2.3): 1.56)。 ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ = 7.71-7.68 (m, 2 H), 7.51 (s, 1 H), 7.49 (d, 1 H), 7.16-7.10 (m, 3 H), 6.75-6.74 (m., 1 H)。

根據圖式 8 製備式(VIII)之起始物質：

4,5-二氯-N-苯基嘧啶-2-胺 (VIII-1)

將 400 毫克的 2-苯胺基-5-氯嘧啶-4(3H)-酮在 2 毫升磷

鹽氣中的溶液在 95°C 加熱 18 小時。冷卻後，在減壓下將反應混合物濃縮，加入水並用二氯甲烷(3 x 20 毫升)萃取。將合併的有機層經由 MgSO_4 乾燥並在減壓下將溶劑去除。如此得到 450 毫克的 4,5-二氯-N-苯基嘧啶-2-胺(VIII-1) ($\log P$ (pH 2.3): 3.52)。 ^1H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 9.31 (br, s, 1 H), 8.33 (s, 1 H), 7.60-7.57 (m, 2 H), 7.40-7.36 (m, 2 H), 7.2.-7.16 (m., 1 H)。

下面化合物可以在類似的方法下製備：

5-溴-2-氯-N-苯基嘧啶-2-胺(VIII-2) ($\log P$ (pH 2.3): 3.64)。

根據方法 2d (圖式 8)製備式(VIII)之起始物質：

4-氯-2-(苯基氨基)嘧啶-5-腈(VIII-3)

在 55°C，將 1.76 克(25.5 毫莫耳)的亞硝酸鈉每次少量下添加至 1.80 克(8.52 毫莫耳)的 4-氨基-2-(苯基氨基)嘧啶-5-腈(Lit: *J Het. Chem.* 1987, 24, 1305)在 22.5 毫升冰醋酸之溶液中，並將混合物在此溫度攪拌 18 小時。將反應混合物冷卻至 0°C，加入 150 毫升水並將混合物用醋酸乙酯(5 x 50 毫升)萃取。將合併的有機層經由 MgSO_4 乾燥並在減壓下將溶劑去除。所得的產物是 4-羥基-2-(苯基氨基)嘧啶-5-腈(VII-2)，其不再有任何進一步的處理而與 16 毫升的磷鹽氣在 100°C 反應 3 小時。將反應混合物濃縮，然後將 100 毫升的冰水添加至殘留物中並將混合物用二氯甲烷(3x 30 毫升)萃取。將合併的有機層經由 MgSO_4 乾燥並在減壓下將溶劑去除。然後將粗產物在矽膠上經由管柱層析法純化(環己烷/醋酸乙酯)。如此得到 650 毫克(16%) of 4-氯-2-(苯基

胺基)嘧啶-5-腈(VIII-3)(logP (pH 2.3): 2.66)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 10.65 (m, 1 H), 8.87-8.83 (m, 1 H), 7.70-7.64 (m, 2 H), 7.41-7.34 (m, 2 H), 7.15-7.115 (m., 1 H)。

根據圖式 5 製備式(VIII)之起始物質：

4-氯-N-[3-(丙-2-基)苯基]-5-(三氟甲基)嘧啶-2-胺 (VIII-4)

在 0°C，將 2.76 毫升的氯化鋅在乙醚中的 1M 溶液添加至 500 毫克(2.30 毫莫耳)的 2,4-二氯-5-(三氟甲基)嘧啶在 20 毫升第三丁醇/二氯甲烷(1:1)的溶液中，並將混合物攪拌 1 小時。然後加入溶解在 10 毫升第三丁醇/二氯甲烷(1:1)中的 312 毫克(2.30 毫莫耳)的 3-異丙基苯胺及 0.35 毫升(2.54 毫莫耳)的三乙胺，並使反應混合物溫熱至室溫。經 16 小時後，在減壓下將溶劑移除，將 40 毫升水添加至殘留物中並將混合物用醋酸乙酯(3 x 50 毫升)萃取。將合併的有機層經由 MgSO₄ 乾燥並在減壓下將溶劑去除。然後將粗產物在矽膠上經由管柱層析法純化(環己烷/醋酸乙酯)。如此得到 140 毫克(20%)所要的產物(logP (pH 2.3): 4.87)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 10.38 (m, 1 H), 8.74 (d, 1 H), 7.56 (m, 1 H), 7.51-7.49 (m, 1 H), 7.28-7.24 (m, 1 H), 6.98 (m, 1 H), 2.89-2.84 (mt, 1 H), 1.23-1.21 (m, 6 H)。

根據圖式 6 製備式(Ia)、(Ib)及(Ic)之化合物：

5-氯-N⁴-(2-甲氧基乙基)-N⁴-甲基-N²-苯基嘧啶-2,4-二胺(化合物 222)

將 97 毫克(1.09 毫莫耳)的 N-(2-甲氧基乙基)-N-甲胺及 302 毫克(2.17 毫莫耳)的碳酸鉀添加至 250 毫克(1.04 毫莫

耳)的 4,5-二氯-N-苯基嘧啶-2-胺在 5 毫升二甲基甲醯胺的溶液中，並將反應混合物在 90°C 加熱 16 小時。冷卻後，將反應混合物攪拌至 20 毫升水中並用醋酸乙酯(3x30 毫升)萃取。將合併的有機層經由 MgSO₄ 乾燥並在減壓下將溶劑去除。如此得到 259 毫克(78%)所要的產物(logP (pH 2.3): 2.02)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ = 9.02 (s, 1 H), 7.96 (s, 1 H), 7.64 (d, 2 H), 7.23 (dd, 2 H), 6.91 (dd., 1 H), 3.80 (t, 2 H), 3.59 (t, 2 H), 3.26 (s, 3H), 3.22 (s, 3 H)。

2-(苯基胺基)-4-(丙基胺基)嘧啶-5-腈(化合物 68)

將 50 毫克(0.84 毫莫耳)的正丙胺及 73 毫克(0.72 毫莫耳)的三乙胺添加至 150 毫克(0.65 毫莫耳)的 4-氯-2-(苯基胺基)嘧啶-5-腈在 5 毫升乙腈的溶液中，並將反應混合物在 50°C 加熱 5 小時。冷卻後，將反應混合物攪拌至 10 毫升水中並用二氯甲烷(3x 20 毫升)萃取。將合併的有機層經由 MgSO₄ 乾燥並在減壓下將溶劑去除。如此得到 170 毫克(95%)所要的產物(logP (pH 2.3): 2.68)。¹H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 9.52 (m, 1 H), 8.29-8.28 (m, 1 H), 7.77-7.71 (m, 2 H), 7.51 (br. s 1 H), 7.29-7.25 (m., 2 H), 7.01-9.97 (m, 1 H), 3.40-3.35 (m, 2 H), 2.66-2.53 (m, 2 H), 0.93-0.88 (m, 3 H)。

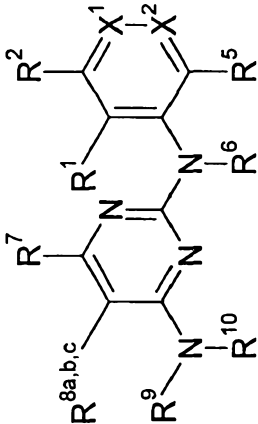
N⁴-環戊基-N²-[3-(丙-2-基)苯基]-5-(三氟甲基)嘧啶-2,4-二胺(化合物 257)

將 130 毫克(1.52 毫莫耳)的環戊胺及 175 毫克(1.27 毫莫耳)的碳酸鉀添加至 400 毫克(1.27 毫莫耳)的 4-氯-N-[3-(丙-2-基)苯基]-5-(三氟甲基)嘧啶-2-胺在 20 毫升乙腈

的溶液中，並將反應混合物在 50°C 加熱 5 小時。冷卻後，將反應混合物攪拌至 10 毫升水中並用二氯甲烷(3x 20 毫升)萃取。將合併的有機層經由 MgSO_4 乾燥並在減壓下將溶劑去除。如此得到 364 毫克(78%)所要的產物(logP (pH2.7): 5.08)。 ^1H NMR (400 MHz, DMSO-d) δ = 9.32-9.29 (m, 1 H), 8.15 (d, 1 H), 4.70 (d, 1 H), 7.19-7.15 (m, 1 H), 6.87-6.85 (m, 1 H), 6.18-6.16 (m, 1 H), 4.58-4.53 (m, 1 H), 2.88-2.82 (m, 1 H), 2.03-1.96 (m, 2H), 1.74-1.69 (m, 2 H), 1.58-1.53 (m, 4 H), 1.22-1.20 (m, 6 H)。

實例

列在下面表 I 之式(Ia)、(Ib)、(Ic)化合物同樣可經由上述方法獲得。



(Ia), (Ib) und (Ic) [und = 及]

實例	R ⁵	X ² = CR ⁴	X ¹ = CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
1	H	甲氧基	甲氧基	甲氧基	H	H	H	Cl	H	2-甲氧基 乙基		1.45[a]; 1.45[b]
2	H	氯	H	H	H	H	H	Cl	H	2-甲氧基 乙基		2.13[a]; 2.13[b]
3	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	2-甲氧基 乙基		1.41[a]
4	H	甲氧基	H	甲氧基	H	H	H	Cl	H	2-甲氧基 乙基		1.67[a]
5	H	乙酯基	H	H	H	H	H	Cl	H	2-甲氧基 乙基		1.49[a]; 1.49[b]
6	H	H	二甲基胺磺 鹽基	H	H	H	H	Cl	H	2-甲氧基 乙基		1.9[a]; 1.9[b]

實例	R ³	X ² =CR ⁴	X ¹ =CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
7	H	H	4-(第三丁氧基羰基)六氫吡啶-1-基	H	H	H	H	Cl	H	2-甲氧基乙基		2.05[a]; 2.05[b]
8	H	H	丙-2-氧基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基丙-2-基		1.69[a]
9	H	H	丙-2-基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基丙-2-基		2.38[a]
10	H	氯	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基丙-2-基		2.58[a]
11	H	H	丙-2-基	H	H	H	H	Cl	H	2-甲氧基乙基		2.09[a]
12	H	H	丙-2-氧基	H	H	H	H	Cl	H	2-甲氧基乙基		1.78[a]
13	H	H	二乙胺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基丙-2-基		1.16[a]
14	H	甲氧基	H	甲氧基	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基丙-2-基		1.94[a]
15	H	乙醯基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基丙-2-基		1.72[a]
16	H	H	二甲基胺磺醯基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基丙-2-基		2.25[a]; 2.26[b]
17	H	氯	H	H	H	H	H	Cl	H	1-羥基丁-2-基		1.96[a]
18	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	1-羥基丁-2-基		1.41[a]
19	H	甲氧基	H	甲氧基	H	H	H	Cl	H	1-羥基丁-2-基		1.64[a]

實例	R ⁵	X ² = CR ⁴	X ¹ = CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
20	H	甲氧基	甲氧基	甲氧基	H	H	H	Cl	H	1-羥基丁-2-基		1.42[a]
21	H	乙醯基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-羥基丁-2-基		1.53[a]
22	H	H	二甲基胺磺醯基	H	H	H	H	Cl	H	1-羥基丁-2-基		1.83[a]
23	H	H	4-(第三丁氧基羰基)六氫吡啶-1-基	H	H	H	H	Cl	H	1-羥基丁-2-基		2.02[a]
24	H	甲氧基	甲氧基	甲氧基	H	H	H	CF ₃	H	1-甲氧基丙-2-基		2.46[b]
25	H	H	H	H	H	H	H	CF ₃	H	1-甲氧基丙-2-基		2.96[a]; 3.52[c]; 2.74[b]
26	H	H	二甲基胺磺醯基	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃		1.61[a]
27	H	H	二甲基胺磺醯基	H	H	H	H	Cl	CH ₃	CH ₃		2.49[a]
28	H	H	甲基磺醯基	H	H	H	H	Cl	CH ₃	CH ₃		1.98[a]
29	H	嗎福啉-4-基磺醯基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基丙-2-基		2.1[a]; 2.04[b]
30	H	H	二甲基胺磺醯基	H	H	H	H	Cl	H	(2S)-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基		2.59[a]
31	H	二甲基胺磺醯基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基丙-2-基		2.02[a]; 2.18[b]
32	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	丁基		2.12[a]
33	H	H	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	CH ₃		1.78[a]; 1.73[b]

實例	R ⁵	X ² = CR ⁴	X ¹ = CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
34	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	第三丁基		2.17[a]
35	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃		1.27[a]
36	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.77[a]
37	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	(2R)-1-(甲基胺磺 鹽基)丙 -2-基		2.04[a]
38	H	H	甲氧基羰基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.31[a]; 3.05[c]
39	H	H	甲氧基羰基	H	H	H	H	Cl	CH ₃	CH ₃		2.47[a]; 3.3[c]
40	H	H	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	丁-2-基		2.85[a]
41	H	乙鹽基	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	丁-2-基	HCl	2.88[a]
42	H	乙鹽基	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	CH ₃	HCl	1.84[a]
43	H	二甲基胺磺 鹽基	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	丙-2-基		2.96[a]
44	H	H	H	H	H	H	H	Cy an	CH ₃	CH ₃		2.36[b]
45	H	乙鹽基	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	丙-2-基	HCl	2.5[a]
46	H	H	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	丙-2-基	HCl	2.45[a]
47	H	二甲基胺磺 鹽基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		2.08[a]
48	H	(3-甲基-2-酮 基咪唑啉-1- 基)甲基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		2.56[c]; 1.54[b]
49	H	乙鹽基	H	H	H	H	H	Cl	H	第三丁基		2.15[a]
50	H	乙鹽基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基	HCl	1.79[a]
51	H	二甲基胺磺 鹽基	H	H	H	H	H	Cl	H	第三丁基		2.73[a]

實例	R ⁵	X ² = CR ⁴	X ¹ = CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
52	H	二甲基胺磺 鹽基	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	丁-2-基		3.33[a]
53	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	2-羥基乙 基	HCl	0.86[a]
54	H	甲氧基	H	甲氧基	H	H	H	Cl	H	2-羥基乙 基	HCl	1.26[a]
55	H	甲氧基	甲氧基	甲氧基	H	H	H	Cl	H	2-羥基乙 基	HCl	1.09[a]
56	H	乙鹽基	H	H	H	H	H	Cl	H	2-羥基乙 基	HCl	1.06[a]
57	H	H	二甲基胺磺 鹽基	H	H	H	H	Cl	H	2-羥基乙 基	HCl	1.4[a]
58	H	H	丙-2-基	H	H	H	H	Cl	H	2-羥基乙 基	HCl	1.6[a]
59	H	H	丙-2-氧基	H	H	H	H	Cl	H	2-羥基乙 基	HCl	1.48[a]
60	H	H	H	H	H	H	H	Cl	乙 基	乙 基		2.29[a]
61	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	2-甲氧基 乙 基	HCl	1.41[a]; 1.41[b]
62	H	甲氧基	H	甲氧基	H	H	H	Cl	H	2-甲氧基 乙 基	HCl	1.67[a]; 1.67[b]
63	H	H	嗎福啉-4-基 磺 鹽基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.18[a]
64	H	H	嗎福啉-4-基 磺 鹽基	H	H	H	H	Cl	H	第三丁基		2.84[a]
65	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	丁-2-基	HCl	2.04[a]

實例	R ⁵	X ² =CR ⁴	X ¹ =CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
66	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-烯 -1-基	HCl	1.68[a]
67	H	H	H	H	H	H	H	氧基	H	2-(甲基胺 磺鹽基)乙 基		2.6[b]
68	H	H	H	H	H	H	H	氧基	H	丙基		2.68[b]
69	H	H	氣	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.8[b]
70	H	H	氣	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.95[b]
71	H	氣	H	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.82[b]
72	H	二甲基胺磺 鹽基	H	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.37[b]
73	氣	H	氣	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.16[b]
74	H	甲氧基	甲氧基	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.55[b]
75	H	-OCF ₂ CF ₂ O-		H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		4.08[b]
76	H	甲基磺鹽基	氣	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.23[b]
77	H	甲基胺磺鹽 基	H	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.3[b]
78	H	H	丙鹽基	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.57[b]

實例	R ⁵	X ² = CR ⁴	X ¹ = CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
79	H		-CH ₂ CH ₂ N(COCH ₃)-	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.55[b]
80	H	乙噻基胺基	H	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.11[b]
81	氟	H	氟	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.02[b]
82	H	H	CF ₃	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		3.22[b]
83	H	氧基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.11[b]
84	H	甲氧基	甲氧基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.46[b]
85	H	甲氧基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.78[b]
86	H	H	甲氧基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.56[b]
87	H	三氟甲氧基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		3.14[b]
88	H	H	(三氟甲基)胺 磺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		3.81[b]
89	H	氟	甲基胺磺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.77[b]
90	H	H	1,3-噻唑-4- 基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.87[b]
91	H	H	2-甲氧基-2- 酮基乙基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.71[b]
92	H		-OCF ₂ CF ₂ O-	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		3.85[b]

實例	R ⁵	X ² =CR ⁴	X ¹ =CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
93	H	2-甲氧基-2-酮基乙基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.75[b]
94	H	氯	H	氯	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		4.08[b]
95	H	氯	甲氧基羰基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.95[b]
96	H	乙氧基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.04[b]
97	H	亞甲基雙(氧基)	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.56[b]
98	H											
99	H	H	乙醯基(甲基) 胺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.48[b]
100	H	甲基磺醯基	氯	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.09[b]
101	H	甲基胺磺醯基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.13[b]
102	H	H	氧基乙醯基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.09[b]
103	H	-CH ₂ CH ₂ CO-		H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.97[b]
104	H	H	丙醯基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.36[b]
105	H	-N=C(CH ₃)S-		H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.75[b]
106	H	-SCOO-		H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.11[b]

實例	R ⁵	X ² = CR ⁴	X ¹ = CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
107	H	-CH ₂ CH ₂ N(COCH ₃)-		H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.48[b]
108	H	氣基	H	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.26[b]
109	H	甲氧基	H	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.9[b]
110	H	H	甲氧基	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.63[b]
111	H	氣	甲基胺磺醯	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.99[b]
112	H	H	1,3-噻唑-4-基	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.99[b]
113	H	2-甲氧基-2-酮基乙基	H	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.87[b]
114	H	氣	H	氣	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		4.32[b]
115	H	氣	甲氧基羰基	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		3.14[b]
116	H	乙氧基	H	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.18[b]
117	H	亞甲雙(氧基)		H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.64[b]
118	H	氣	三氣甲氧基	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		4.23[b]
119	H	H	乙醯基(甲基)胺基	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.56[b]
120	H	嗎福咻-4-基磺醯基	H	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.16[b]

實例	R ³	X ² =CR ⁴	X ¹ =CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
121	H	H	氧基乙鹽基	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.23[b]
122	H	-N=C(CH ₃)S-		H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.87[b]
123	H	-SCOO-		H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.26[b]
124	H	甲基胺磺鹽基	H	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.4[b]
125	H	甲氧基	乙鹽基胺基	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.46[b]
126	H	H	苯基胺磺鹽基	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.92[b]
127	H	H	甲基胺磺鹽基	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.46[b]
128	H	H	丙-2-烯-1-基 胺磺鹽基	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.75[b]
129	H	(乙氧基羰基) 胺基	H	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.87[b]
130	H	(甲基胺磺鹽基)氧基	H	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.56[b]
131	H	H	甲鹽基胺基	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.3[b]
132	H	甲鹽基胺基	H	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.43[b]
133	H	-CH ₂ CH ₂ CONH-		H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.38[b]
134	H	-OCONH-		H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.29[b]

實例	R ⁵	X ² =CR ⁴	X ¹ =CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
135	H	H	甲基 胺磺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.38[b]
136	H	H	丙-2-烯-1-基 胺磺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.64[b]
137	H	H	第三丁基 胺磺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.06[b]
138	H	H	甲磺基胺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.28[b]
139	H	-CH ₂ CH ₂ CONH-		H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.3[b]
140	H	甲氧基	乙磺基胺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.38[b]
141	H	H	苯基 胺磺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.8[b]
142	H	胺磺基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.32[b]
143	H	(乙氧基羰基) 胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.78[b]
144	H	(甲磺基) 胺磺基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.48[b]
145	H	H	甲磺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.85[b]
146	H	H	(2,2-二甲基 丙磺基)胺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.78[b]
147	H	(2,2-二甲基 丙磺基)胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.9[b]
148	H	H	二甲胺磺 基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.51[b]

實例	R ⁵	X ² =CR ⁴	X ¹ =CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
149	H	H	甲基 胺磺鹽	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.06[b]
150	H	六氫吡啶-1-基 磺鹽	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.77[b]
151	H	H	3,3-二甲基 -2-氧基丁基 乙鹽	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.26[b]
152	H	H	乙鹽	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.02[b]
153	H	(甲氧基羰基)-胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.59[b]
154	H	甲基 胺磺鹽	CH ₃	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.33[b]
155	H	二甲基 胺磺鹽	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.47[b]
156	H	(2-甲氧基丙基)-胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.68[b]
157	H	第三丁基 胺磺鹽	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.99[b]
158	H	H	1,1,2,2-四氧 乙基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.61[b]
159	H	乙鹽	羥基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.68[b]
160	H	氟	羥基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.34[b]
161	H	H	乙鹽(環己基)胺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.33[b]
162	H	[(1-甲基環丙基)羰基]胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.78[b]

實例	R ⁵	X ² = CR ⁴	X ¹ = CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
163	H	H	(2,2-二甲基 丙醯基)(甲 基)胺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.87[b]
164	H	H	環丙基(三氧 乙醯基)胺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.55[b]
165	H	(苯氧基羰 基)-胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.23[b]
166	H	(3-氧-2,2-二 甲基-丙醯基) 胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.83[b]
167	H	乙醯基胺基	CH ₃	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.37[b]
168	H	(吡喃-2-基羰 基)-胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.68[b]
169	H	H	(2-甲基丙醯 基)胺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.59[b]
170	H	-N(CH ₃)COCH ₂ O-		H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.56[b]
171	H	CH ₃	羥基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.39[b]
172	H	H	(二氧甲基)胺 磺醯基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.8[b]
173	H	甲基胺磺醯 基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		2.36[a]; 3.89[c]

實例	R ⁵	X ² = CR ⁴	X ¹ = CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
174	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	2-甲基 -1-(甲基 胺磺鹽 基)-丙-2- 基		2.68[a]; 4.18[c]
175	H	甲基胺磺鹽 基	H	H	H	H	H	Cl	H	2-甲基 -1-(甲基 胺磺鹽 基)-丙-2- 基		3.48[a]; 4.59[c]
176	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 -3-甲基丁 -2-基		2.33[b]
177	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	2-(三氟甲 氧基)-乙 基		2.26[b]
178	H	H	H	H	H	H	H	Br	CH ₃	CH ₃		1.86[b]
179	H	乙磺基	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	丁-2-基		2.88[a]
180	H	氧基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		2.21[b]
181	H	甲氧基	乙磺基胺基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.44[b]
182	H	甲氧基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.86[b]
183	H	H	甲氧基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.63[b]
184	H	H	氧基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		2.46[b]
185	H	三氟甲氧基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		3.26[b]
186	H	H	甲基磺鹽基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.86[b]
187	H	氧	甲基胺磺鹽 基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		2.91[b]

實例	R ⁵	X ² = CR ⁴	X ¹ = CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
188	H	H	(2,2-二甲基-丙基)胺基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.81[b]
189	H	H	乙基胺基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.32[b]
190	H	氣	乙基胺基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.61[b]
191	H	H	乙基(乙基)胺基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.66[b]
192	H	H	乙基(甲基)胺基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.51[b]
193	H	H	(三氣乙基)胺基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.93[b]
194	H	H	[(1-甲基環丙基)羰基]胺基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.71[b]
195	H	乙基胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.39[b]
196	H	(2-甲基丙基)胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.66[b]
197	H	(2,2-二甲基丙基)胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.91[b]
198	H	六氫吡啶-1-基磺基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		2.08[b]
199	H	H	3,3-二甲基-2-酮基丁基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		2.3[b]
200	H	H	乙基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		2.06[b]
201	H	H	(甲氧基羰基)胺基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.53[b]
202	H	H	(乙氧基羰基)胺基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.66[b]
203	H	(甲基胺磺基)氣基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.53[b]

實例	R ⁵	X ² =CR ⁴	X ¹ =CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
204	H	(甲氧基羰基)胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.59[b]
205	H	-OCONH-		H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.44[b]
206	H	-N(COCH ₃)CH ₂ CH ₂ -		H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.61[b]
207	H	[(1-甲基環丙基)羰基]胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.78[b]
208	H	乙醯基胺基	CH ₃	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.42[b]
209	H	H	(2-甲基丙醯基)胺基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.61[b]
210	H	-NHCOCH ₂ CH ₂ CH ₂ -		H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.56[b]
211	H	1,1,2,2-四氧乙氧基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		2.88[b]
212	H	H	(二氧甲基)胺磺醯基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		2.88[b]
213	H	H	羥基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.24[b]
214	H	羥基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.39[b]
215	H	-NHCH=CH-		H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.63[b]
216	H	(乙氧基羰基)胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.81[b]
217	H	-COOCH ₂ -		H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基丙-2-基		1.61[b]
218	H	-COOCH ₂ -		H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基丙-2-基		1.73[b]
219	H	甲基胺磺醯基	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	丙-2-基		3.45[a]; 4.64[c]
220	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	氧基甲基		1.62[a]; 2.2[c]
221	H	甲基胺磺醯基	H	H	H	H	H	Cl	H	氧基甲基		2.27[a]

實例	R ⁵	X ² = CR ⁴	X ¹ = CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
222	H	H	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	2-甲氧基 乙基		2.02[a]
223	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	1-羥基丙 -2-基		1.04[a]
224	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 -3-甲基丁 -2-基		2.55[b]
225	H	CH ₃	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.98[b]
226	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基 戊-2-基		2.52[a]
227	H	H	3-甲基-2,5- 二酮基咪唑 啉-1-基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		1.41[b]
228	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	己-3-基		2.44[a]
229	H	CH ₃	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		3.84[c]; 2[b]
230	H	乙基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		4.25[c]; 2.33[b]
231	H	H	H	H	H	H	H	Br	CH ₃	1-甲氧基 -3-甲基丁 -2-基		2.47[a]
232	H	H	H	H	H	H	H	Br	CH ₃	1-甲氧基 丁-2-基		2.23[a]
233	H	H	H	H	H	H	H	Br	CH ₃	4-甲基戊 -2-基		3.39[d]
234	H	H	二甲基胺磺 鹽基	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		2.27[c]; 1.44[b]
235	H	氧基甲基	H	H	H	H	H	Cl	H	CH ₃		1.1[b]
236	H	氧基甲基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.69[c]

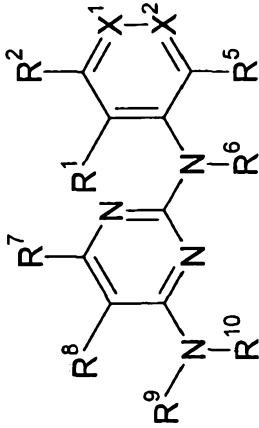
實例	R ⁵	X ² =CR ⁴	X ¹ =CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
237	H	H	H	H	H	H	H	Br	CH ₃	2-乙氧基 乙基		3.95[c]; 2.55[b]
238	H	甲基 胺磺鹽	H	H	H	H	H	Cl	H	乙基		3.46[c]; 1.92[b]
239	H	甲基 胺磺鹽	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	乙基		4.32[c]; 2.99[b]
240	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	乙基		3.03[c]; 1.38[b]
241	H	H	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	乙基		3.85[c]; 2.11[b]
242	H	[甲基(丙-2- 基)胺磺鹽] 甲基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		3.44[c]; 2.18[b]
243	H	[乙基(甲基) 胺磺鹽] 甲基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		3.18[c]; 1.96[b]
244	H	甲磺基	H	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基 丙-2-基		2.75[c]; 1.8[b]
245	H	H	二甲基 胺磺基	H	H	H	H	Br	H	丙-2-基		1.54[b]
246	H	氧基 甲磺基	H	H	H	H	H	Br	H	丙-2-基		3.13[c]; 1.84[b]
247	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	丙-2-基		3.7[c]; 1.89[b]
248	H	[(1-苯基乙 基)胺磺鹽] 甲基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		3.57[c]; 2.32[b]
249	H	乙磺基	H	H	H	H	H	Cl	H	環己基	HCl	2.53[b]
250	H	(二甲基胺磺 鹽基)甲磺基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		2.85[c]; 1.69[b]
251	H	(苄基胺磺鹽 基)甲磺基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		3.35[c]; 2.18[b]

實例	R ⁵	X ² = CR ⁴	X ¹ = CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
252	H	甲鹽基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		3.06[c]; 1.86[b]
253	H	H	H	H	H	H	H	Br	H	環戊基		2.47[b]
254	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	環戊基		2.28[b]
255	H	2-酮基丙基	H	H	H	H	H	Cl	H	環戊基		2.01[b]
256	H	甲基胺磺鹽基	H	H	H	H	H	Cl	H	環戊基		2.93[b]
257	H	丙-2-基	H	H	H	H	H	CF ₃	H	環戊基		5.08[b]
258	H	氣	H	H	H	H	H	Cl	H	環己基		3.81[b]
259	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	環己基		2.53[b]
260	H	甲氧基	H	甲氧基	H	H	H	Cl	H	環己基		2.77[b]
261	H	甲氧基	甲氧基	甲氧基	H	H	H	Cl	H	環己基		2.26[b]
262	H	乙鹽基	H	H	H	H	H	Cl	H	環己基		2.53[a]
263	H	H	二甲基胺磺鹽基	H	H	H	H	Cl	H	環己基		3.18[b]
264	H	H	4-(第三丁氧基羰基)六氫吡啶-1-基	H	H	H	H	Cl	H	環己基		2.95[b]
265	H	H	二乙胺基	H	H	H	H	Cl	H	環己基		1.69[a]
266	H	H	乙鹽基	H	H	H	H	Cl	H	環己基		2.77[a]
267	H	H	甲基磺鹽基	H	H	H	H	Cl	H	環己基		2.54[a]
268	H	H	氣	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		
269	H	H	H	H	H	H	H	Cl	乙基	丙-2-基		3[b]
270	H	H	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	2-甲基丙基		3[b]
271	H	H	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	丙-2-烯-1-基		4.03[c]; 2.66[b]

實例	R ³	X ² = CR ⁴	X ¹ = CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
272	H	H	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	丙基		4.35[c]; 2.55[b]
273	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	2,2-二甲基丙基		2.48[b]
274	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	戊-2-基		2.41[b]
275	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	戊-3-基		2.34[b]
276	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	2-甲基丁基		2.37[b]
277	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	3-甲基丁基		2.37[b]
278	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	戊基		2.41[b]
279	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	2-甲基丙基		2.02[b]
280	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	丙基		1.69[b]
281	H	二氣甲基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		2.4[b]
282	H	甲基胺磺鹽	H	H	H	H	H	Cl	CH ₃	丁基		3.9[b]
283	H	甲基胺磺鹽	H	H	H	H	H	Cl	H	2-甲基丙基		2.69[b]
284	H	甲基胺磺鹽	H	H	H	H	H	Cl	H	丙基		3.87[c]; 2.3[b]
285	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	2-羥基乙基		1.83[c]; 0.7[b]
286	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-烯-1-基		3.1[c]; 1.64[b]
287	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	(三甲基矽烷基)甲基		2.14[b]

實例	R ⁵	X ² = CR ⁴	X ¹ = CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	logP
288	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	2-甲基丙-2-烯-1-基		2.62[b]
289	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	3-甲基丁-2-烯-1-基		2.17[b]
290	H	甲基(丙醯基)胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		2.89[c]; 1.76[b]
291	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	1-(三甲基矽烷基)乙基		2.66[b]
292	H	甲基胺基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.32[b]
293	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	2-(甲基胺磺醯基)乙基		1.75[b]
294	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	丁-3-烯-1-基		1.87[b]
295	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	3-甲氧基丁-2-基		3.64[c]; 2.04[b]
296	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H	丁-2-基		2.05[b]
297	H	H	H	H	H	H	H	CH ₃	H	第三丁基		1.48[b]
298	H	1H-吡啶-1-基 甲基	H	H	H	H	H	Cl	H	丙-2-基		1.7[b]

列在下面表 II 之式(I)化合物同樣可經由上述方法獲得。



(I)

Bsp	R ⁵	X ²	X ¹ =CR ³	R ²	R ¹	R ⁶	R ⁷	R ⁸	R ⁹	R ¹⁰	HX	log p
II-1	H	N	甲氧基	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基丙-2-基		1.53[a]; 1.52[b]
II-2	H	N	甲氧基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基丙-2-基		1.39[b]
II-3	H	N	環丙基胺基	H	H	H	H	Cl	H	1-甲氧基丙-2-基		1.17[b]
II-4	H	N	經基	H	H	H	H	Br	H	1-甲氧基丙-2-基		0.58[a]

logP 值是根據 EEC Directive 79/831 Annex V.A8 經由 HPLC (高效能液相層析法)

在逆相管柱(C18)使用下面的方法測定：

[a]在 pH 2.3 的酸性範圍使用移動相 0.1% 磷酸水溶液及乙腈進行測定，線性梯度從 10 % 乙腈至 95% 乙腈。

[b]在酸性範圍之 LC-MS 測定是在 pH 2.7 使用移動相 0.1% 甲酸水溶液及乙腈(含 0.1% 甲酸)進行，線性梯度從 10% 乙腈至 95% 乙腈。

[c]在中性範圍之 LC-MS 測定是在 pH 7.8 使用移動相 0.001 莫耳濃度碳酸氫銨水溶液及乙腈進行測定，線性梯度從 10% 乙腈至 95% 乙腈。

使用有已知的 logP 值(在兩種連續烷酮之間使用線性插入法經由滯留時間測定 logP 值)之直鏈烷-2-酮(含有 3 至 16 個碳原子)進行校正。

使用從 200 毫微米至 400 毫微米之 UV 光譜在最大的層析訊號測定 λ -max。

從表1之實 例編號	¹ H NMR	M+1
1	¹ H NMR (乙腈-d ₃ , 嘔啖-H): δ = 7.87	369.1
2	¹ H NMR (乙腈-d ₃ , 嘔啖-H): δ = 7.91	313
3		279.1
4		339
5	¹ H NMR (乙腈-d ₃ , 嘔啖-H): δ = 8.32	321.1
6	¹ H NMR (乙腈-d ₃): δ = 11.34 (br. s, 1H), 7.95 (s, 1 H), 7.87 (d, 2H), 7.78 (d, 2H), 3.75 (m, 2H), 3.62 (m, 2 H), 3.33 (s, 3 H), 2.67 (s, 6H).	386.1
7	¹ H NMR (乙腈-e-d ₃ , 嘔啖-H): δ = 7.85	463.2
8	¹ H NMR (乙腈-d ₃): δ = 10.46 (br. s, 1H), 7.85 (s, 1 H), 7.45 (d, 2H), 6.90 (d, 2H), 6.69 (br.s, 1H), 4.54 (m, 1H), 4.37 (m, 1 H), 3.48 (m, 2 H), 3.31 s (3 H), 1.29 (d, 6H), 1.25 (d, 3H).	351.1
9		335.1
10		327.1
11	¹ H NMR (乙腈-d ₃ , 嘔啖-H): δ = 7.85	321.2
12	¹ H NMR (乙腈-d ₃ , 嘔啖-H): δ = 7.90	337.2
13	¹ H NMR (乙腈-d ₃ , 嘔啖-H): δ = 7.83	364.1
14		353.1
15		335.1
16	¹ H NMR: δ = 10.53 (br. s, 1H), 8.19 (s, 1 H), 7.91 (d, 2H), 7.75 (br. s, 1H), 7.69 (d, 2H), 4.48 - 4.46 (m, 1H), 3.55 - 3.52 (m, 1 H), 3.40 - 3.37 (m, 1 H), 3.26 (s, 3H), 2.59 (s, 6 H), 1.22 (d, 3 H).	400.1
17	¹ H NMR (嘔啖-H): δ = 8.03	327.1
18	¹ H NMR (嘔啖-H): δ = 8.06	293.1
19		353.2
20	¹ H NMR (嘔啖-H): δ = 8.07	383.1
21		335.2
22		400.2
23		477.3
24	¹ H NMR (嘔啖-H): δ = 8.16	417.2
25	¹ H NMR (嘔啖-H): δ = 8.18	327.1
26		342
27		356.1
28		327.1
29		442.1
30		416.1
31		400.1
32		277.1
33		249.1
34		277.1

從表1之實 例編號	¹ H NMR	M+1
35		235.1
36		263.1
37		309
38	¹ H NMR: δ = 9.60 (br. s, 1H), 8.02 (s, 1 H), 7.86 – 7.81 (m, 4H), 6.76 (d, 1H), 4.45 – 4.42 (m, 1H), 3.81 (s, 3 H), 3.54 – 3.50 (m, 2 H), 3.41 – 3.38 (m, 2H), 1.22 (d, 3 H).	351.1
39	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 8.03	307.1
40	¹ H NMR (乙腈-d ₃ , 嘧啶-H): δ = 7.95	291
41		333.1
42		291.1
43		384.1
44	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 8.33	240
45		319.2
46		277.1
47		370.1
48	¹ H NMR: δ = 8.95 (br. s, 1H), 7.89 (s, 1 H), 7.67 (s, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.18 (dd, 1 H), 6.77 (d, 1 H), 6.42 (d, 1 H), 4.30 (m, 1H), 4.20 (s, 2H), 3.25 (m, 2 H), 3.14 (m, 2H), 2.67 (s, 3 H), 1.23 (d, 6H).	375.1
49		319.1
50		305
51		384
52	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 8.03	398.1
53		265.1
54		325
55		355.1
56		307.1
57		372.1
58		307.1
59		323.2
60		277.1
61	¹ H NMR (乙腈-d ₃ , 嘧啶-H): δ = 7.88	279.1
62	¹ H NMR (乙腈-d ₃ , 嘧啶-H): δ = 7.88	339
63		442.1
64		426.2
65		277.1
66		261.1
67	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 8.30	286.1
68	¹ H NMR: δ = 9.52 (s, 1H), 8.29-8.28 (m, 1H), 7.76-7.71 (m 2H), 7.51 (br. s, 1H), 7.29-7.25 (m, 2H), 6.99-6.97 (m, 1H), 3.4-3.35 (m, 2H), 1.65-1.58 8m, 2H), 0.93-0.88 (m, 3H)	254,2
69		311
70	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 8.00 (s, 1 H)	356
71	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 8.06 (s, 1 H)	372

從表1之實 例編號	¹ H NMR	M+1
72	¹ H NMR: δ = 9.45 (s, 1 H), 8.33 (s, 1 H), 8.06 (s, 1 H), 7.91 (dd, 1 H), 7.48 (t, 1 H), 7.25 (dd, 1 H), 6.28 (br. d, 1 H), 4.49 (m, 1 H), 3.50 (dd, 1 H), 3.40 (dd, 1 H), 3.28 (s, 3 H), 2.64 (s, 6 H), 1.22 (d, 3 H).	445
73		372
74		396.1
75		466
76		448
77		382
78		392.1
79		419.1
80	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 7.98 (s, 1 H)	395
81		328.1
82		360.1
83		317.1
84		352.1
85		322.1
86		322.1
87		376.1
88		392.1
89		372.1
90		375.1
91		364.1
92		422.1
93		364.1
94		360
95		384.1

從表1之實 例編號	¹ H NMR	M+1
96		336.1
97		336.1
98		410
99		363.2
100		404
101		338.1
102		359.1
103		346.1
104		348.1
105		363.1
106		366.1
107		375.2
108		361
109		366.1
110		366.1
111		416
112		419
113		408.1
114		404
115		428
116		380.1
117		380
118		454
119		407.1
120		485.1

表 1 之 實 例 編號	¹ H NMR	M+1
121		403.1
122		407
123		410
124		393.1
125		423.1
126		455.1
127		393.1
128		419.1
129		423.1
130		409.1
131		379.1
132		379.1
133		405.1
134		394.1
135		349.1
136		375.2
137		391.2
138		335.1
139		361.1
140		379.1
141		411.1
142		349.1
143		379.1
144		365.1
145		370.1

從表1之實 例編號	¹ H NMR	M+1
146		391.1
147		391.1
148		363.1
149		338.1
150		439.1
151		390.2
152		334.1
153		365.1
154		352.1
155		363.1
156		377.2
157		391.2
158		408.1
159		350.1
160		326.1
161		431.2
162		389.1
163		
164		443.1
165		427.1
166		409.1
167		363.1
168		401.1
169		377.1
170		377.1

例編號	¹ H NMR	M+1
171		322.1
172		374.1
173	¹ H NMR: δ = 8.99 (br. s, 1H), 7.91 (s, 1 H), 7.78 (s, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.16 (dd, 1 H), 6.81 (d, 1 H), 6.49 (d, 1 H), 4.34 (m, 1H), 2.44 (s, 3 H), 1.24 (d, 6 H).	309.1
174	¹ H NMR (嘓啖-H): δ = 7.94	323.1
175	¹ H NMR (嘓啖-H): δ = 7.96	369
176	¹ H NMR (嘓啖-H): δ = 7.94	321.1
177		332.1
178		292
179		333.1
180		288.1
181		350.1
182		293.1
183		293.1
184		288.1
185		347.1
186		341.1
187		343.1
188		362.2
189		320.1
190		354.1
191		348.2
192		334.1
193		374.1
194		360.1
195		320.1
196		346.1
197		362.1
198		410.1
199		361.1
200		305.1
201		336.1
202		350.1
203		336.1
204		336.1
205		320.1
206		346.1
207		360.1
208		334.2
209		348.1
210		346.1
211		379
212		345

從表1之實 例編號	¹ H NMR	M+1
213		279.1
214		279.1
215		302.1
216		350.1
217		348.1
218		392
219	¹ H NMR: δ = 9.10 (br. s, 1H), 7.99 (s, 1 H), 7.71 (dd, 1H), 7.42 (dd, 1H), 7.18 (dd, 1 H), 6.83 (dd, 1 H), 4.73 (m, 1 H), 2.98 (s, 3H), 2.44 (s, 3 H), 1.21 (d, 6 H).	323.1
220	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 8.05	260
221	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 8.06	306.1
222	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 7.96 (s, 1 H).	293
223	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 7.91 (s, 1 H).	279
224	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 8.01	367.1
225	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 7.91	307.1
226	¹ H NMR: δ = 8.95 (s, 1 H), 7.97 (s, 1 H), 7.67 (dd, 2 H), 7.19-7.29 (m, 2 H), 6.87-6.93 (m, 1 H), 6.08 (d, 1 H), 4.22-4.29 (m, 1 H), 3.28-3.51 (m, 2 H), 3.27 (s, 3 H), 1.56-1.66 (m, 2 H), 1.24-1.38 (m, 2 H), 0.86-0.92 (m, 3 H).	366
227		404.1
228	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 7.97 (s, 1 H).	350
229	¹ H NMR: δ = 8.84 (br. s, 1H), 7.89 (s, 1 H), 7.61 (s, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.09 (dd, 1 H), 6.71 (d, 1 H), 6.42 (d, 1 H), 4.30 (m, 1H), 2.26 (s, 3 H), 1.24 (d, 6H).	277.1
230	¹ H NMR: δ = 8.84 (br. s, 1H), 7.89 (s, 1 H), 7.65 (s, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.12 (dd, 1 H), 6.74 (d, 1 H), 6.43 (d, 1 H), 4.34 (m, 1H), 2.55 (q, 2 H), 1.24 (d, 6H), 1.53 (t, 3 H).	291.1
231	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 8.07 (s, 1 H).	380
232	¹ H NMR: δ = 9.01 (s, 1 H), 8.09 (s, 1 H), 7.65 (dd, 2 H), 7.22 (dd, 2 H), 6.89 (dd, 1 H), 4.65-4.69 (m, 1 H), 3.42-3.59 (m, 2 H), 3.25 (s, 3 H), 2.99 (s, 3 H), 1.61-1.68 (m, 2 H), 0.86-0.89 (m, 3 H).	366
233	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 8.09 (s, 1 H)	364/366
234	¹ H NMR: δ = 9.16 (br. s, 1H), 7.93 (s, 1 H), 7.75 (d, 2H), 7.30 (d, 2H), 6.50 (d, 1 H), 4.33 (m, 1H), 2.96 (s, 3 H), 1.24 (d, 6H).	334.1
235	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 7.88	274.1

從表1之實 例編號	¹ H NMR	M+1
236	¹ H NMR: δ = 9.07 (br. s, 1H), 7.91 (s, 1 H), 7.85 (s, 1H), 7.55 (d, 1H), 7.23 (dd, 1 H), 6.86 (d, 1 H), 6.47 (d, 1 H), 4.36 (m, 1H), 3.92 (s, 2H), 1.24 (d, 6H).	302.1
237	¹ H NMR (嘓啖-H): δ = 8.09 (s, 1 H).	352
238	¹ H NMR (嘓啖-H): δ = 7.90	295
239	¹ H NMR: δ = 9.05 (br. s, 1H), 7.97 (s, 1 H), 7.71 (s, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.18 (dd, 1 H), 6.81 (d, 1 H), 3.65 (q, 2H), 3.15 (s, 3 H), 2.44 (s, 3 H), 1.20 (t, 3H).	309.1
240	¹ H NMR (嘓啖-H): δ = 7.89	249.1
241	¹ H NMR (嘓啖-H): δ = 7.96	263.1
242	¹ H NMR (嘓啖-H): δ = 7.93	412.1
243	¹ H NMR (嘓啖-H): δ = 7.90	398.1
244	¹ H NMR (乙腈-d ₃): δ = 9.96 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.92-7.75 (m, 2H), 7.55-7.45 (m, 2H), 5.45 (s, 1H), 4.51-4.39 (1H, s), 3.55-3.42 (m, 2H), 3.33 (s, 3H), 1.27 (d, 3H)	321.1
245	¹ H NMR: δ = 9.18 (br. s., 1H), 8.02 (s, 1H), 7.76-7.74 (m, 2H), 7.31-7.30 (br. d 2H), 4.32-4.30 (m, 1H), 2.96 (s, 6H), 1.26-1.24 (m, 6H)	380.1
246	¹ H NMR (嘓啖-H): δ = 8.01	346
247	¹ H NMR: δ = 8.93 (br. s, 1H), 7.99 (s, 1 H), 7.68 (d, 2H), 7.22 (dd, 2H), 6.89 (t, 1 H), 6.14 (d, 1 H), 4.31 (m, 1H), 1.24 (d, 6H).	307
248	¹ H NMR: δ = 8.95 (br. s, 1H), 7.89 (s, 1 H), 7.71 (s, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.48 (d, 1 H), 7.33 (m, 4 H), 7.21 (m, 2 H), 6.78 (d, 1 H), 6.42 (d, 1H), 4.44 (m 1 H), 4.31 (m, 1H), 4.00 (m, 2 H), 1.39 (d, 3 H), 1.23 (d, 6H).	460.1
249		345
250	¹ H NMR: δ = 9.04 (br. s, 1H), 7.91 (s, 1 H), 7.86 (s, 1H), 7.61 (d, 1H), 7.22 (dd, 1 H), 6.94 (d, 1 H), 6.45 (d, 1H), 4.37 (m 1 H), 4.25 (s, 2 H), 2.74 (s, 6 H), 1.24 (d, 6H).	384.1
251	¹ H NMR: δ = 9.78 (br.s, 1 H), 8.04 (s, 1 H), 7.70 (s, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.48 (d, 1 H), 7.43 (br.s, 1 H), 7.30 (m, 5 H), 7.02 (d 1H), 4.37 (m 1 H), 4.25 (s, 2H), 4.10 (d, 2 H), 1.23 (d, 6H).	446.1

從表I之實 例編號	¹ H NMR	M+1
252	¹ H NMR: δ = 9.95 (s, 1H), 9.28 (s, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.91-7.86 (m, 1H), 7.48-7.43 (m, 2H), 6.53 (d, 1H), 4.43-4.30 (m, 1H), 1.25 (d, 6H)	291.1
253		332
254	¹ H NMR: δ = 8.93 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.72-7.70 (m, 2H), 7.24-7.20 (m, 2H), 6.91-6.89 (m, 1H), 6.52-6.50 (d, 1H), 4.40-4.36 (m, 1H), 2.04-1.98 (m, 2H), 1.73-1.69 (m, 2H), 1.62-1.58 (m, 4H)	289.1
255	¹ H NMR: δ = 8.94 (br. S, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.66 (d, 1H), 7.53-7.51 (q, 1H), 7.19-7.15 (m, 1H), 6.76-6.74 (m, 1H), 6.51-6.49 (m, 1H), 4.40-4.38 (m, 1H), 3.57-3.55 (s, 3H), 2.10 (s, 2H), 1.99-1.96 (m, 2H), 1.73-1.70 (m, 2H), 1.61-1.57 (m, 4H),	345.1
256	¹ H NMR: δ = 8.98 (s, 1H), 7.91 8s, 1H), 7.83-7.82 (d, 1H), 7.44-7.42 (m 1H), 7.18-7.16 (q, 1H), 6.82-6.80 (m, 1H), 6.55-6.50 (m, 1H), 4.42-4.39 (m, 1H), 2.49-2.48 (s, 3H), 2.04-2.00 (m, 2H), 1.73-1.70 (m, 2H)	335.1
257	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 8.15	365.2
258		337
259		303
260		363
261		393
262		345
263		410
264		487.2
265	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 7.88	374.2
266	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 8.06	345.2
267		381.1
269		291.3
270		291.3
271	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 7.99	275.1
272	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 7.95	277.1
273		291.3
274		291.3
275		291.3
276		291.3
277		291.3
278		291.4
279		277.3

從表1之實 例編號	¹ H NMR	M+1
280		263.3
281	¹ H NMR: δ = 9.20 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.72-7.71 (q, 1H), 7.37-7.33 (m, 1H), 7.07-7.05 (m, 1H), 6.50 (d, 1H), 4.36-4.34 (m, 1H), 1.25-1.23 (q, 6H)	313.1
282	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 7.94	337.2
283		323.4
284		309.4
285	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 7.91	265.1
286	¹ H NMR: δ = 8.92 (s, 1H), 7.92 (s, 1 H), 7.67 (d, 2H), 7.22 (dd, 2H), 7.11 (br.s, 1H), 6.88 (dd, 1 H), 5.94 (m, 1H), 5.15 (m, 2 H), 4.05 (m, 2 H).	261.2
287		307.2
288		275.2
289		289.2
291		321.2
293		295.2
294		
294		275.2
295	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 7.93	307.1
296	¹ H NMR: δ = 8.90 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.70-7.67 (m, 2H), 7.24-7.20 (m, 2H), 6.89-6.86 (m, 1H), 4.15-4.11 (m, 1H), 1.68-1.63 (m, 1H), 1.57-1.52 (m, 1H), 1.21-1.19 (q, 3H), 0.91-0.87 (m, 3H)	277.1
297	¹ H NMR (嘧啶-H): δ = 8.42	257.2
298	¹ H NMR: δ = 9.19 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.75-7.73 (M, 2H), 7.55-7.53 (m, 1H), 7.44-7.43 (s, 1H), 7.20-7.16 (m, 1H), 6.74-6.70 (m, 2H), 6.26-6.25 (d, 1H), 5.25 (d, 2H), 4.33-4.19 (m, 1H), 1.23-1.21 (q, 6H)	343.1
290	¹ H NMR: δ = 9.34 (br. s, 1H), 7.95 (s, 1 H), 7.86 (s, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.29 (dd, 1 H), 6.81 (m, 2 H), 4.29 (m, 1H), 3.13 (s, 3 H), 2.06 (m, 2 H), 1.21 (d, 6H), 0.92 (t, 3H).	348.2
292	¹ H NMR: δ = 8.85 (s, 1H), 7.88 (s, 1 H), 7.03 (s, 1H), 6.91 (dd, 1H), 6.84 (d, 1 H), 6.62 (d, 1 H), 6.14 (d, 1H), 5.40 (s, 1 H), 4.39 (m, 1 H), 2.67 (m, 3 H), 1.21 (d, 6H).	292.2

從表1之實 例編號	¹ H NMR	M+1
Ia-1	¹ H NMR: δ = 8.90 (s, 1 H), 8.38 (d, 1 H), 7.98 (s, 1 H), 7.95 (dd, 1 H), 6.72 (d, 1 H), 6.12 (br. d, 1 H), 4.34 (m, 1 H), 3.81 (s, 3 H), 3.48 (dd, 1 H), 3.37 (dd, 1 H), 3.28 (s, 3 H), 1.20 (d, 3 H).	369
Ia-2	¹ H NMR: δ = 8.89 (s, 1 H), 8.39 (d, 1 H), 7.96 (dd, 1 H), 7.89 (s, 1 H), 6.70 (d, 1 H), 6.40 (br. d, 1 H), 4.36 (m, 1 H), 3.81 (s, 3 H), 3.48 (dd, 1 H), 3.36 (dd, 1 H), 3.28 (s, 3 H), 1.20 (d, 3 H).	324
Ia-3		348.1
Ia-4	¹ H NMR: δ = 8.57 (s, 1 H), 7.94 (s, 1 H), 7.70 (d, 1 H), 7.58 (dd, 1 H), 6.28 (d, 1 H), 6.09 (br. d, 1 H), 4.30 (m, 1 H), 3.46 (dd, 1 H), 3.37 (dd, 1 H), 3.22 (br. s, 1 H), 1.17 (d, 3 H).	355

除非另外指出，化學NMR位移是在溶劑DMSO-d₆中使用四甲基矽烷作為內標在400 MHz以ppm測量。

下面縮寫描述訊號分裂情形：

s = 單裂峰，d = 雙裂峰，t = 三裂峰，q = 四裂峰，m = 多裂峰

實例 A

黑星菌測試(蘋果) / 保護

溶劑： 24.5 重量組份的丙酮

24.5 重量組份的二甲基乙醯胺

乳化劑： 1 重量組份的烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造活性物質之合適製劑，將 1 重量組份之活性物質與所示量之溶劑與乳化劑混合，並將濃縮劑用水稀釋至所要的濃度。

為了測試保護的活性，將幼小植物在所述的使用率下噴灑活性化合物之製劑。噴霧塗層乾燥後，將植物接種蘋果瘡痂病原體蘋果黑星菌(*Venturia inaequalis*)之水性分生孢子懸浮液且隨後在約 20°C 及 100% 相對濕度之培養櫥內停留 1 天。

然後將植物放在約 21°C 及約 90% 相對濕度之溫室內。

培養經 10 天後進行評估。0% 係指相當於對照組之效應，而 100% 係指沒有觀察到感染。

在此測試中，從表 I 之實例編號 4、25、36、77、84、93、96、109、113、127、128、130、135、136、137、144、151、183、189、191、192、199、202、203、204、214、245、249 及 250 在 100 ppm 之活性化合物濃度下顯示 70% 或更大的功效。

實例 B**鏈格菌測試(番茄)/保護**

溶劑： 49 重量組份的 N,N-二甲基甲醯胺

乳化劑： 1 重量組份的烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造活性物質之合適製劑，將 1 重量組份之活性物質與所示量之溶劑與乳化劑混合，並將濃縮劑用水稀釋至所要的濃度。

為了測試保護的活性，將幼小番茄植物在所述的使用率下噴灑活性化合物之製劑。處理經 1 天後，將植物接種番茄早疫病菌(*Alteraria solani*)之孢子懸浮液且隨後在 100%相對濕度及 22°C 停留 24 小時。然後將植物保持在 96%相對濕度及 20°C 之溫度。

培養經 7 天後進行評估。0%係指相當於對照組之效應，而 100%係指沒有觀察到感染。

在此測試中，從表 I 之實例編號 3、4、29、48、72、74、80、83、85、93、96、107、109、110、113、119、121、122、125、126、128、129、130、131、132、135、136、137、138、139、140、144、188、189、190、191、192、193、195、198、199、203、204、207、212、213、214、232、234、236、238、242、243、245、248、227、249、250、255 及 262 在 500 ppm 之活性化合物濃度下顯示 70%或更大的功效。

實例 C

網紋菌測試(大麥) /保護

溶劑： 49 重量組份的 N,N-二甲基甲醯胺

乳化劑： 1 重量組份的烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造活性物質之合適製劑，將 1 重量組份之活性物質與所示量之溶劑與乳化劑混合，並將濃縮劑用水稀釋至所要的濃度。

為了測試保護的活性，將幼小大麥植物在所述的使用率下噴灑活性化合物之製劑。處理經 1 天後，將植物接種大麥網紋菌(*Pyrenophora teres*)之水性孢子懸浮液且隨後在 100%相對濕度及 22°C 停留 48 小時。然後將植物保持在 80%相對濕度及 20°C 之溫度。

培養經 7-9 天後進行評估。0%係指相當於對照組之效應，而 100%係指沒有觀察到感染。

在此測試中，從表 I 之實例編號 4、25、47、50、62、65、66、69、70、72、74、79、84、85、86、96、99、101、103、109、110、116、121、122、124、125、128、129、130、131、132、135、136、138、140、143、144、145、152、153、165、166、182、183、186、188、189、192、195、196、197、199、203、204、213、214、216、229、230、232、234、236、238、239、240、241、242、243、245、246、247、250、252、253、254、256、281、283、284、285 and 286 及從表 II 之實例 II-1 及 II-2 在 500 ppm 之活性化合物濃度下顯示 70%或更大的功效。

實例 D**雪腐鏟刀菌測試(小麥)/保護**

溶劑： 50 重量組份的 N,N-二甲基乙醯胺

乳化劑： 1 重量組份的烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造活性物質之合適製劑，將 1 重量組份之活性物質與所示量之溶劑與乳化劑混合，並將濃縮劑用水稀釋至所要的濃度。

為了測試保護的活性，將幼小植物在所述的使用率下噴灑活性化合物之製劑。噴霧塗層乾燥後，將植物接種雪腐鏟刀菌之孢子懸浮液。將植物放置在溫室腔內在 10°C 及 100% 相對濕度之半透明培養櫃內。

培養經 5 天後進行評估。0% 係指相當於對照組之效應，而 100% 係指沒有觀察到感染。

在此測試中，從表 I 之實例編號 25、69、70、74、84、96、110、125、129、130、135、144、173、234、245 及 256 及從表 II 之實例 II-1 在 1000 ppm 之活性化合物濃度下顯示 70% 或更大的功效。

實例 E

稻熱菌測試(水稻) / 保護

溶劑： 28.5 重量組份的丙酮

乳化劑： 1.5 重量組份的烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造活性物質之合適製劑，將 1 重量組份之活性物質與所示量之溶劑與乳化劑混合，並將濃縮劑用水及所述量的乳化劑稀釋至所要的濃度。

為了測試保護的活性，將幼小水稻植物在所述的使用率下噴灑活性化合物之製劑。處理經 1 天後，將植物接種稻熱菌(*Pyricularia oryza*)之水性孢子懸浮液。然後將植物放置在 100%相對濕度及 25°C 之溫室內。

培養經 5 天後進行評估。0%係指相當於對照組之效應，而 100%係指沒有觀察到感染。

在此測試中，從表 I 之實例編號 229、236、245、250、252 及 255 在 250 ppm 之活性化合物濃度下顯示 80%或更大的功效。

實例 F**立枯絲核菌測試(水稻) /保護**

溶劑： 28.5 重量組份的丙酮

乳化劑： 1.5 重量組份的烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造活性物質之合適製劑，將 1 重量組份之活性物質與所示量之溶劑與乳化劑混合，並將濃縮劑用水及所述量的乳化劑稀釋至所要的濃度。

為了測試保護的活性，將幼小水稻植物在所述的使用率下噴灑活性化合物之製劑。處理經 1 天後，將植物接種立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*)之菌絲。然後將植物放置在 100%相對濕度及 25°C 之溫室內。

培養經 4 天後進行評估。0%係指相當於對照組之效應，而 100%係指沒有觀察到感染。

在此測試中，從表 I 之實例編號 144、245、250 及 255 在 250 ppm 之活性化合物濃度下顯示 80%或更大的功效。

實例 G

胡麻葉斑菌測試(水稻)/保護

溶劑 28.5 重量組份的丙酮

乳化劑： 1.5 重量組份的烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造活性物質之合適製劑，將 1 重量組份之活性物質與所示量之溶劑與乳化劑混合，並將濃縮劑用水及所述量的乳化劑稀釋至所要的濃度。

為了測試保護的活性，將幼小水稻植物在所述的使用率下噴灑活性化合物之製劑。處理經 1 天後，將植物接種水稻胡麻葉斑菌(*Cochliobolus miyabeanus*)之水性孢子懸浮液。然後將植物放置在 100%相對濕度及 25°C 之溫室內。

培養經 4 天後進行評估。0%係指相當於對照組之效應，而 100%係指沒有觀察到感染。

在此測試中，從表 I 之實例編號 236 及 255 在 250 ppm 之活性化合物濃度下顯示 80%或更大的功效。

實例 H

赤霉菌測試(水稻)/保護

溶劑：28.5 重量組份的丙酮

乳化劑：1.5 重量組份的烷基芳基聚乙二醇醚

為了製造活性物質之合適製劑，將 1 重量組份之活性物質與所示量之溶劑與乳化劑混合，並將濃縮劑用水及所述量的乳化劑稀釋至所要的濃度。

為了測試保護的活性，將幼小水稻植物在所述的使用率下噴灑活性化合物之製劑。處理經 1 天後，將植物接種水稻赤霉菌(*Gibberella zeae*)之水性孢子懸浮液。然後將植物放置在 100%相對濕度及 25°C 之溫室內。

培養經 5 天後進行評估。0%係指相當於對照組之效應，而 100%係指沒有觀察到感染。

在此測試中，從表 I 之實例編號 173 在 250 ppm 之活性化合物濃度下顯示 80%或更大的功效。

實例 J**經由鐮胞菌孢子製造伏馬鐮孢毒素FB1**

使用 Lopez-Errasquin et al.: Journal of Microbiological Methods 68 (2007) 312-317 揭示並順應至微滴定盤之方法。

將誘發伏馬鐮孢毒素的液體介質(Jiménez et al., Int. J. Food Microbiol. (2003), 89, 185-193)接種鐮胞菌孢子之濃縮孢子懸浮液(350 000個孢子/毫升, 在-160°C儲存)至最終濃度是2 000個孢子/毫升。

將化合物溶解(10毫莫耳濃度在100% DMSO中)並在H₂O中稀釋至100微莫耳濃度。將化合物在從50微莫耳濃度至0.01微莫耳濃度之間的範圍內之7個濃度測試(稀釋, 在10% DMSO中從使用100微莫耳濃度儲備溶液開始)。

從各稀釋溶液, 將5微升與95微升接種的介質在96-槽微量多孔盤之槽內混合。將平盤覆蓋並在20°C培養6天。

在開始及6天後, 進行OD測量(OD₆₂₀每槽多次讀取(平方: 3 x 3))以計算“pI50”生長。

經6天後, 將液體介質之樣本在10%乙腈中稀釋。經由HPLC-MS/MS分析FB1在稀釋樣本中的濃度, 並使用此結果計算“pI50 FB1”值。

使用下面的參數進行HPLC-MS/MS:

質譜儀: Applied Biosystems API4000 QTrap

HPLC: Agilent 1100

自動注射器: CTC HTS PAL

層析管柱：Waters Atlantis T3 (50x2毫米)

測量的pI50值之實例

經由鐮胞菌孢子製造伏馬鐮孢毒素FB1

實例編號	pI50 Fum	pI50生長
51	5.2	<4.3
74	4.6	<4.3
109	4.7	<4.3
136	4.4	<4.3
152	5	<4.3
173	4.8	<4.3
199	5.4	4.9
203	5.2	4.6
214	6	<4.3
228	5.1	<4.3
229	5.2	4.8
230	5.1	5.2
234	5.3	4.6
236	5.7	5.7

實例 K

經由禾谷镰刀菌製造DON/乙醯基-DON

在誘發DON的液體介質(每升含1克 $(\text{NH}_4)_2\text{HPO}_4$ 、0.2克 $\text{MgSO}_4 \times 7 \text{H}_2\text{O}$ 、3 克 KH_2PO_4 、10 克甘油、5克NaCl 及40克蔗糖)與燕麥萃取物(10%)及DMSO (0.5%)中，將化合物在從0.07微莫耳濃度至50微莫耳濃度之間的範圍內之7個濃度測試。使用禾谷镰刀菌之濃縮孢子懸浮液在2000個孢子/毫升之最終濃度進行接種。

將平盤在28°C 的高大氣濕度下培養7天。

在開始及3天後，在OD520進行OD測量(每槽重複測量：3 x 3次測量)以計算生長抑制作用。

經7天後，加入100微升的84/16乙腈/水混合物，並從各槽取出液體介質之樣本並在10%乙腈中稀釋1:100。經由HPLC-MS/MS分析DON及乙醯基-DON在樣本中的比例，並與沒有活性化合物的對照組比較，使用此測量值計算DON/AcDON製造之抑制作用。

使用下面的參數進行HPLC-MS/MS：

游離型式：ESI 陰性

離子霧化電壓：-4500 V

霧化氣體溫度：500°C

破簇(Decluster)電壓：-40 V

碰撞能量：-22 eV

碰撞氣體：N₂

NMR追蹤：355.0 > 264.9;

HPLC管柱：Waters Atlantis T3 (三功能性C18 bondung, 封蓋)

粒子大小：3微米

管柱尺寸：50 x 2毫米

溫度：40°C

溶劑 A: 水/2.5 毫莫耳濃度 NH_4OAc + 0.05% CH_3COOH (v/v)

溶劑 B: 甲醇/2.5 毫莫耳濃度 NH_4OAc + 0.05% CH_3COOH (v/v)

流速：400微升/分鐘

注射體積：11微升

梯度：

時間[分鐘]	A%	B%
0	100	0
0.75	100	0
1.5	5	95
4	5	95
5	100	0
10	100	0

DON 抑制作用之實例

從表 I 的實例編號 230 在 50 微莫耳濃度顯示 >80% 的 DON/AcDON 抑制作用。實例編號 230 在 50 微莫耳濃度顯示大於 50% 之禾谷镰刀菌的生長抑制作用。

【圖式簡單說明】

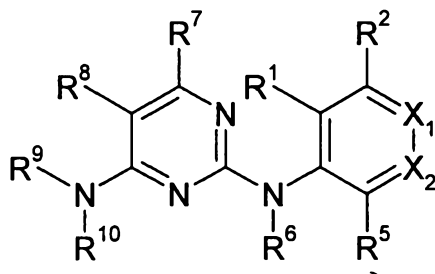
無,

【主要元件符號說明】

無

三、英文發明摘要：

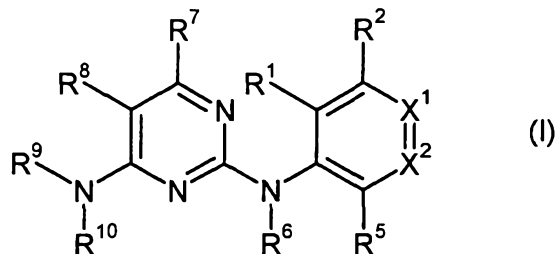
Use of 4-alkyl-substituted diaminopyrimidines of the formula (I) as fungicide



in which R^1 to R^{13} and X^1 and X^2 have the meanings given in the description, and agrochemically active salts thereof, and also methods and compositions for controlling phytopathogenic harmful fungi in and/or on plants or in and/or on seed of plants, processes for preparing such compositions and treated seed and also their use for controlling phytopathogenic harmful fungi in agriculture, horticulture and forestry, in the protection of materials and in the domestic and hygiene field. The present invention furthermore relates to a process for preparing diaminopyrimidines of the formulae (Ia), (Ib) and (Ic).

七、申請專利範圍：

1. 一種式(I)之化合物作為殺真菌劑之用途：



其中符號定義如下：

X^1 代表氮或 CR^3 ，

X^2 代表氮或 CR^4 ，

其中 X^1 及 X^2 不都代表氮，

R^1 及 R^5 彼此獨立地代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_4 -烷氧基或鹵基，

R^2 代表氫、鹵基、硝基、氰基、 C_1 - C_4 -烷基、 C_1 - C_2 -鹵烷基、羥基、 OR^{12} 、 $OCN(R^{12})_2$ 、 COR^{12} 、 $CR^{12}=NOR^{12}$ 、 SF_5 、 SR^{12} 、 SOR^{12} 、 SO_2R^{12} 、 CO_2R^{12} 、 $N(R^{12})_2$ 、 $NR^{12}COR^{12}$ 或 $NR^{12}CO_2R^{13}$ ，

R^3 及 R^4 彼此獨立地代表氫、鹵基、硝基、氰基、3-至8-員未經取代或經取代的飽和或不飽和的單環其不含或含有至多四個選自包括 N、O 及 S 的雜原子，其中兩個氧原子不相鄰、 OR^{12} 、 $OCN(R^{12})_2$ 、 $OCOR^{13}$ 、 SF_5 、 SR^{12} 、 SOR^{12} 、 SO_2R^{12} 、 $SO_2N(R^{13})_2$ 、 $C=OR^{12}$ 、 $CO(CH_2)_mCN$ 、 $CR^{12}=NOR^{12}$ 、 $CON(R^{12})_2$ 、 $COOR^{12}$ 、 $NR^{12}COR^{12}$ 、 $NR^{12}CSR^{13}$ 、 $NR^{12}COOR^{13}$ 、

$\text{NR}^{12}(\text{C}=\text{S})\text{OR}^{13}$ 、 $\text{N}(\text{R}^{12})_2$ 、 $\text{NR}^{12}\text{SO}_2\text{R}^{13}$ 、
 $[\text{C}(\text{R}^{12})_2]_m\text{CN}$ 、 $(\text{CH}_2)_m\text{SON}(\text{R}^{12})_2$ 、
 $(\text{CH}_2)_m\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{12})_2$ 、 $(\text{CR}^{12})_m\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^{12})_2$ 、
 $(\text{CH}_2)_m\text{COOR}^{12}$ 、 $(\text{CH}_2)_m\text{COR}^{12}$ 、 $[\text{C}(\text{R}^{12})_2]_m\text{COR}^{12}$ 、
 $(\text{CH}_2)_m\text{CON}(\text{R}^{12})_2$ 、 $[\text{C}(\text{R}^{12})_2]_m\text{CON}(\text{R}^{12})_2$ 、
 $(\text{CH}_2)_m\text{NR}^{12}\text{COR}^{12}$ 、 $(\text{CH}_2)_m\text{NR}^{12}_2$ 、
 $(\text{CH}_2)_m\text{NR}^{12}\text{COOR}^{13}$ 、 $[\text{C}(\text{R}^{12})_2]_m\text{NR}^{12}\text{COR}^{12}$ 、
 $[\text{C}(\text{R}^{12})_2]_m\text{NR}^{12}\text{COOR}^{13}$ 、未經取代或經取代的
 $\text{C}_1\text{-C}_8$ -烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_6$ -烯基、 $\text{C}_1\text{-C}_8$ -鹵烷基；其中
 $m=1-4$ ，

其中另外 R^3 及 R^4 ，如果適當時經由 R^{12} 及 R^{13} 一起可
 形成 5-至 7-員未經取代或經取代的飽和或不飽和的單
 環其不含或含有至多四個選自包括 N、O 及 S 的雜原
 子，其中兩個氧原子不相鄰，

其中取代基是彼此獨立地選自包括氫、氟、氯及溴、
 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基、羥基、酮基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -鹵烷
 基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 羰基或氰基，

R^6 代表氫、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ -烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ -烷氧基- $(\text{C}_1\text{-C}_4)$ 烷基、
 甲醯基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 羰基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷氧基-}\text{C}_1\text{-C}_4\text{-}$
 $\text{烷基})$ 羰基、 $(\text{C}_3\text{-C}_6\text{-烯氧基})$ 羰基、 $(\text{C}_3\text{-C}_6\text{-環烷基})$
 羰基、 $(\text{鹵基-}\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷氧基-}\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷基})$ 羰基、
 $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-鹵基烷基})$ 羰基、 $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-烷氧基})$ 羰基、
 $(\text{C}_1\text{-C}_4\text{-鹵基烷氧基})$ 羰基、苄氧基羰基、未經取代
 或經取代的苄基、未經取代或經取代的苯甲醯基、

未經取代或經取代的 C_2-C_6 -烯基、未經取代或經取代的 C_2-C_6 -炔基、 C_1-C_2 -烷基亞磺醯基或 C_1-C_2 -烷基磺醯基，

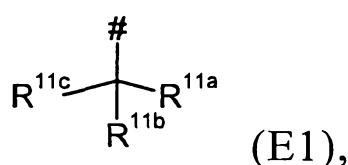
其中取代基是彼此獨立地選自包括氫、氟、氯及溴、 C_1-C_4 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基、羥基、 C_1-C_4 -鹵基烷基及氰基，

R^7 代表氫、 C_1-C_3 -烷基、氰基或 C_1-C_3 -鹵基烷基，

R^8 代表氯、溴、碘、氰基、甲基、SMe、SOMe、SO₂Me、CF₃、CCl₃、CFH₂ 或 CF₂H，

R^9 代表氫、 C_1-C_3 -烷基、 C_1-C_4 -烷氧基- (C_1-C_4) 烷基、 $(C_1-C_4$ -烷基)羰基、 $(C_1-C_4$ -鹵基烷基)羰基、 $(C_1-C_4$ -烷氧基)羰基 或隨意地經氟-、氯-、溴-、氰基-或 CF₃-取代之 C_2-C_4 -烯基，

R^{10} 代表下式之 E1 基



其中符號定義如下且 # 代表連接至氮原子的點：

R^{11a} 代表氫或甲基，

R^{11b} 代表氫或 C_1-C_3 -烷基，

R^{11c} 代表氫、 C_1-C_4 -烷基、CN、CH₂CN、CH(Me)CN、C(Me)₂CN、CH₂OH、CH₂O- $(C_1-C_3$ -烷基)、CH₂O- $(C_1-C_3$ -鹵基烷基)、C(Me)HOH、C(Me)₂OH、C(Me)HO- $(C_1-C_3$ -烷基)、C(Me)₂O- $(C_1-C_3$ -烷基)、

C(Me)HO-(C₁-C₃-鹵基烷基)、C(Me)₂O-(C₁-C₃-鹵基烷基)、CH₂S-(C₁-C₃-烷基)、C(Me)HS-(C₁-C₃-烷基)、C(Me)₂S-(C₁-C₃-烷基)、Si(C₁-C₂-烷基)₃ 或 C₂-C₄-烯基其係隨意地經鹵基或 CF₃ 取代；

或

R¹⁰ 代表環戊基或環己基環其可隨意地經 CN、鹵基、C₁-C₃-烷基、C₁-C₃-烷氧基、C₁-C₃-鹵基烷基、C₁-C₃-鹵基烷氧基或 C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基單-或多取代；

R¹² 是相同或不同且是氫、C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-鹵基烷基、未經取代或經取代的 C₃-C₆-環烷基、C₁-C₄-三烷基矽烷基、未經取代或經取代的 C₂-C₄-烯基、未經取代或經取代的 C₂-C₄-炔基、未經取代或經取代的苯基、C₁-C₄-烷氧基(C₁-C₄)烷基、未經取代或經取代的苄基或 3-至 7-員未經取代或經取代的飽和或不飽和的環其不含或含有至多四個選自包括 N、O 及 S 的雜原子，其中兩個氧原子不相鄰，

或

如果兩個 R¹² 基團是連接至一個氮原子，兩個 R¹² 基團可以形成 3-至 7-員未經取代或經取代的飽和或不飽和的環其不含或含有至多四個選自包括 N、O 及 S 的雜原子，其中兩個氧原子不相鄰，

或

如果兩個 R¹² 基團是在 NR¹²COR¹²、NR¹²SOR¹²、

$\text{NR}^{12}\text{SO}_2\text{R}^{12}$ 、 $\text{NR}^{12}\text{SONR}^{12}$ 、 $\text{NR}^{12}\text{SO}_2\text{NR}^{12}$ 基團中相鄰，兩個 R^{12} 基團可以形成 3-至 7-員未經取代或經取代的飽和或不飽和的環其不含或含有至多四個選自包括 N、O 及 S 的雜原子，其中兩個氧原子不相鄰，

R^{13} 是相同或不同且是 C_1 - C_8 -烷基、 C_1 - C_8 -鹵基烷基、 C_1 - C_4 -三烷基矽烷基、未經取代或經取代的 C_2 - C_6 -烯基、未經取代或經取代的 C_2 - C_6 -炔基、未經取代或經取代的 C_3 - C_6 -環烷基、未經取代或經取代的芳基、 C_1 - C_4 -烷氧基- $(\text{C}_1$ - $\text{C}_4)$ 烷基、未經取代或經取代的苄基或 3-至 7-員未經取代或經取代的飽和或不飽和的環其不含或含有至多四個選自包括 N、O 及 S 的雜原子，其中兩個氧原子不相鄰，

其中兩個 R^{13} 可形成 3-至 7-員未經取代或經取代的飽和或不飽和的環其不含或含有至多四個選自包括 N、O 及 S 的雜原子，其中兩個氧原子不相鄰，

且其中可能的取代基是選自包括下面的名單：

氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、 CF_3 、 CFH_2 、 CF_2H 、 C_2F_5 、 CCl_3 、羥基、 OMe 、 OEt 、 OPr 、 OisoPr 、 OBu 、 OsecBu 、 OisoBu 、 OtertBu 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OCH}_3$ 、 $\text{O}(\text{CH}_2)_3\text{OCH}_3$ 、O-環戊基、O-苯基、 OCF_3 、 OCF_2H 、 OCF_2CF_3 、 $\text{OCF}_2\text{CF}_2\text{H}$ 、 SH 、 SMe 、 SEt 、 SCF_3 、 SCF_2H 、 SPh 、 SCF_5 、 SO_2Me 、 SO_2CF_3 、 SOMe 、 SOEt 、 CO_2H 、 CO_2CH_3 、 CO_2Et 、 CO_2Pr 、 CO_2isoPr 、 CO_2tertBu 、 COMe 、

COCF₃、NH₂、NHMe、NMe₂、NH₄Et、NEt₂、NHPr、NH₄isoPr、NH₄nBu、NH₄tertBu、NH₄isoBu、NH₄secBu、環丙胺基、甲醯基、CH₂CN、CHMeCN、CH₂COCH₃、CH₂OMe、(CH₂)₂OMe、(CH₂)₃OMe、CH₂OH、CH₂SMe、(CH₂)₂SMe、甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、環丙基、1-甲氧基環丙基、1-氯環丙基、環丁基、3-二甲基丁基、環戊基、環己基、環己基甲基、新戊基、丙-2-烯-1-基、1-甲基丙-2-烯-1-基、丁-3-烯-1-基、(三甲基矽烷基)甲基、苯基、苄基、-CH₂CH=CH₂、-CH(CH₃)CH=CH₂、-CH₂C≡CH,

及其農藝化學活性鹽類。

2. 根據申請專利範圍第 1 項之式(I)化合物之用途,

X¹ 代表氮或 CR³,

X² 代表氮或 CR⁴,

其中 X¹ 及 X² 不都代表氮,

R¹ 及 R⁵ 彼此獨立地代表氫、C₁-C₂-烷基、C₁-C₂-烷氧基、F、Cl 或 Br,

R² 代表氫、鹵基、硝基、氰基、C₁-C₄-烷基、C₁-C₂-鹵烷基、羥基、C₁-C₄-烷氧基、O-(C₂-C₄-烯基)、O-(C₂-C₄-炔基)、OCONH-(C₁-C₄-烷基)、OCON-(C₁-C₄-烷基)₂、C₁-C₃-鹵烷氧基、COH、CO-(C₁-C₄-烷基)、C(=NOH)Me、C(=NO)-(C₁-C₄-烷基)Me、CH(=NO)-(C₁-C₄-烷基)、SF₅、S-(C₁-C₃)-

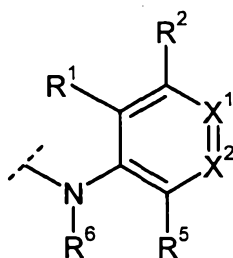
烷基、S-(C₁-C₂)-鹵烷基、SO-(C₁-C₄-烷基)、
 SO₂-(C₁-C₄-烷基)、CO₂-(C₁-C₃-烷基)、NH₂、
 NH-(C₁-C₄-烷基)、N-(C₁-C₄-烷基)₂、NHCO-(C₁-C₄-
 烷基)、NHCOH、NMeCO-(C₁-C₄-烷基)或
 NHCO₂-(C₁-C₄-烷基),

R³ 及 R⁴ 彼此獨立地代表氫、鹵基、氰基、硝基、羥基、
 O-(C₁-C₄)-烷基、O-(C₃-C₆-環烷基)、O-(C₁-C₄-鹵烷
 基)、OCONH-(C₁-C₄-烷基)、OCON-(C₁-C₄-烷基)₂、
 OCO-(C₁-C₄-烷基)、SH、SF₅、S-(C₁-C₃-烷基)、
 S-(C₁-C₃-鹵烷基)、SPh、SO-(C₁-C₄-烷基)、
 SO₂-(C₁-C₄-烷基)、SO₂-(C₂-C₄-烯基)、SO₂-(C₂-C₄-
 炔基)、SO₂-(C₁-C₂-鹵烷基)、SO₂N-(C₁-C₄-烷基)₂、
 甲醯基、CO-(C₁-C₄-烷基)、(C₁-C₃-鹵烷基)羰基、
 COCH₂CN、CONH-(C₁-C₄-烷基)、CON-(C₁-C₄-烷
 基)₂、CONH-(C₁-C₃-鹵烷基)、CONH-(C₂-C₄-烯基)、
 CONH-(C₂-C₄-炔基)、CONH-(C₃-C₆-環烷基)、
 CONHCH(CH₃)CH₂OCH₃、CONH(CH₂)_mO-(C₁-C₄-
 烷基)、CONHPh、六氫吡啶-1-基羰基、嗎福啉-4-
 基羰基、(4-甲基六氫吡啶-1-基)羰基、吡咯啉-1-
 基羰基、吡丁啉-1-基羰基、氮丙啶-1-基羰基、六
 甲基亞胺-1-基羰基、嗎福啉-1-基羰基、硫嗎福
 啉-1-基羰基、COOH、(C₁-C₄-烷氧基)羰基、
 CO₂(CH₂)_mO-(C₁-C₄-烷基)、NHCO-(C₁-C₄-烷基)、
 NHCO-(C₁-C₄-鹵烷基)、N-(C₁-C₃-烷基)-CO-(C₁-C₄-

烷基)、N-(C₁-C₃-烷基)-CS-(C₁-C₄-烷基)、
 NHCO-(C₂-C₄-烯基)、NH(C=S)O-(C₁-C₄-烷基)、
 NHCOPh、NHCO(CH₂)_mO-(C₁-C₄-烷基)、NHCHO、
 N-(C₁-C₄-烷基)CHO、NHCO₂-(C₁-C₄-烷基)、
 NHCO₂Ph、NHCO₂-(C₁-C₂-鹵烷基)、N-(C₁-C₄-烷
 基)-CO₂-(C₁-C₄-烷基)、NH₂、NH-(C₁-C₄-烷基)、
 N-(C₁-C₂-烷基)₂、環丙基胺基、
 NHCH(CH₃)CH₂OCH₃, 乙醯基(環丙基)胺基、[(1-
 甲基環丙基)羰基]胺基、嗎福啉-1-基、嗎福啉-4-
 基甲基、NHSO₂-(C₁-C₄-烷基)、CH₂CN, CHMeCN、
 CH₂SO₂NH-(C₁-C₄-烷基)、CH₂SO₂N-(C₁-C₄-烷基)₂、
 C(Me)HSO₂N-(C₁-C₄-烷基)₂、CH₂CO-(C₁-C₄-烷基)、
 CH(CH₃)COCH₃、CH₂CO-(C₃-C₆-環烷基)、
 CH₂CONH-(C₁-C₄-烷基)、CH₂CO₂-(C₁-C₄-烷基)、
 CH₂NHCOO-(C₁-C₄-烷基)、CH=NO-(C₁-C₄-烷基)、
 C(CH₃)=NO-(C₁-C₄-烷基)、CH₂NHCO-(C₁-C₄-烷
 基)、CH₂NHCO-(C₁-C₄-鹵烷基)、C₁-C₆-烷基、C₃-C₆-
 環烷基、1-甲氧基環丙基、1-氯環丙基、C₂-C₆-烯
 基、C₁-C₃-鹵烷基、嗎福啉-4-基磺醯基、(3-甲基-2,5-
 二酮基咪唑啉-1-基)、3-甲基-2-酮基咪唑啉-1-基、
 (3-甲基-2-酮基咪唑啉-1-基)甲基、六氫吡啶-1-基
 磺醯基、1,3-噻唑-2-基、1,3-噻唑-4-基、3,5-二甲
 基六氫吡啶-1-基、4-(第三丁氧基羰基)六氫吡啶-1-
 基、5-乙氧基-3,4-二甲基-1H-吡唑-1-基、乙醯基(環

己基)氨基、2-呋喃甲磺基氨基、5-乙氧基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基、3-(2-氯乙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、1,1-二氧基異噻唑啉-2-基、1,1-二氧基四氫噻吩-2-基、4-甲基-5-酮基-4,5-二氫-1H-1,2,4-三唑-1-基、3-甲基-5-酮基-2,5-二氫-1H-吡唑-1-基、2-(甲氧基甲基)吡咯啉-1-基、2-酮基環戊基、2-酮基四氫呋喃-3-基、1-甲基-3-酮基-2,3-二氫-1H-吡唑-4-基、1-甲基-3-酮基吡唑啉-4-基、四氫呋喃-2-基、呋喃-2-基、5-甲基-1,1-二氧基-1,2,5-噻二唑啉-2-基、(苄基胺磺基)甲基、(呋喃-2-基羰基)氨基、[(1-苯基乙基)胺磺基]甲基、5-酮基-3-(丙-2-基)-4,5-二氫-1H 吡唑-1-基、5-酮基-3-(三氟甲基)-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、1H-四唑-5-基、(環丙基羰基)氨基、4,4-二甲基-2,5-二酮基咪唑啉-1-基、2,3-二甲基-5-酮基-2,5-二氫-1H-吡唑-1-基、5-噻酮基-4,5-二氫-1H-四唑-1-基、3-(1-甲基乙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、3-(2-甲基丙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、2-酮基-3-丙-2-烯-1-基咪唑啉-1-基、3-第三丁基-2-酮基咪唑啉-1-基、吡咯啉-1-基磺基、2,5-二酮基咪唑啉-4-基、(嗎福啉-4-基磺基)甲基、(六氫吡啶-1-基磺基)甲基、(吡咯啉-1-基磺基)甲基、2-酮基咪唑啉-1-基、3-甲基-5-酮基-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、3,4-二甲基-5-酮基-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、1-甲基環戊基、吡咯啉-1-基、六氫吡啶-1-

基、2-酮基-2,5-二氫-1H-吡咯-1-基、3,3-二甲基-2-酮基環戊基、3-酮基-4,5-二甲基-2,4-二氫-吡唑-2-基、3-酮基-4-乙基-5-甲基-2,4-二氫吡唑-2-基、3-酮基-5-三氟甲基-2,4-二氫吡唑-2-基、3-酮基-5-異丙基-2,4-二氫吡唑-2-基、3,5-二酮基-4,4-二甲基吡唑啉-1-基、3,5-二酮基-4-乙基吡唑啉-1-基、3-酮基-4,4-二甲基吡唑啉-1-基、2,5-二酮基-2,5-二氫-1H-吡咯-1-基、3-酮基丁基、4-甲氧基-2-酮基-2,5-二氫-1H-吡咯-1-基、2-酮基-2,5-二氫-1H-吡咯-1-基、5-酮基-4,5-二氫-1H-咪唑-1-基、1,1-二氧基-1,2-噻吡-2-基、6-甲基-1,1-二氧基-1,2,6-噻二吡-2-基、環丙基(三氟乙醯基)胺基，其中 $m=1-3$ ，
而且，如果 R^3 及 R^4 ，如果適當時經由 R^{12} 或 R^{13} 形成環，下面通式(I)的次單元：

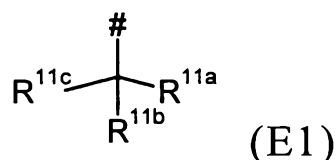


可以是(2-酮基-2,3-二氫-1H-吡唑-5-基)胺基、1H-吡唑-6-基胺基、1H-吡唑-5-基胺基、2-[(三氟甲基)-1H-苯並咪唑-6-基]胺基、(3-甲基-1,1-二氧基-2H-1,2,4-苯並噻二吡-7-基)胺基、(1,1-二氧基-2H-1,2,4-苯並噻二吡-6-基)胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並噻吡

-6-基)胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘓咩
 -7-基)胺基、(1-乙醯基-2,3-二氫-1H-吲哚-6-基)胺基、
 (4H-1,3-苯並二氧芑-7-基)胺基、(2-酮基-2,3,4,5-四氫
 -1H-1-苯並吡庚因-8-基)胺基、(2,2-二氧基-1,3-二氫-2-
 苯並噻吩-5-基)胺基、(1-酮基-2,3-二氫-1H-茛-5-基)胺
 基、[2-(乙基磺醯基)-2,3-二氫-1,3-苯並噻唑-6-基]胺
 基、(2,2,3,3-四氟-2,3-二氫-1,4-苯並二氧芑-6-基)胺基、
 1,3-苯並二嘓茂-5-基胺基、(1,3-二酮基-2,3-二氫-1H-
 異吲哚-5-基)胺基、(2-甲基-1,3-苯並噻唑-6-基)胺基、
 (2-酮基-2,3-二氫-1H-苯並咪唑-5-基)胺基、(2-酮基-1,3-
 苯並嘓噻-5-基)胺基、(2-酮基-2,3-二氫-1,3-苯並嘓唑
 -5-基)胺基、(2-乙基-1,3-苯並嘓唑-5-基)胺基、(2-酮基
 -1,2,3,4-四氫喹啉-6-基)胺基、(3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-
 苯並嘓咩-6-基)胺基、(2-酮基-2,3-二氫-1,3-苯並嘓唑
 -6-基)胺基、3-酮基-1,3-二氫-2-苯並呋喃-5-基)胺基、
 [2-(乙基磺醯基)-1,3-苯並噻唑-6-基]胺基、(2-甲基-1,3-
 苯並噻唑-5-基)胺基、(1-乙醯基-2,3-二氫-1H-吲哚-5-
 基)胺基、(2,2,3,3-四氟-2,3-二氫-1,4-苯並二氧芑-6-基)
 胺基、(2,2-二氧基-1,3-二氫-2-苯並噻吩-5-基)胺基、(2-
 酮基-2,3-二氫-1H-吲哚-6-基)胺基、(2-酮基-1,2,3,4-四
 氫喹啉-7-基)胺基、1H-吲哚-6-基胺基,

R^6 代表氫、 C_1 - C_3 -烷基、 CH_2OCH_3 、 $CH_2CH_2OCH_3$ 、甲
 醯基、(C_1 - C_4 -烷基)羰基、(C_1 - C_4 -鹵烷基)羰基、
 (C_1 - C_4 -烷氧基)羰基、苄氧基羰基、苄基、4-甲氧

基苄基、2,4-二甲氧基苄基、2-羥基苄基、未經取代或經取代之苯甲醯基、未經取代或經取代之 C_2-C_4 -烯基、未經取代或經取代之 C_2-C_4 -炔基、 C_1-C_2 -烷基亞磺醯基或 C_1-C_2 -烷基磺醯基，其中取代基是彼此獨立地選自包括氫、氟、氯及溴、 C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_2 -鹵烷基及氰基， R^7 代表氫、甲基、氰基、 CF_3 、 CFH_2 或 CF_2H ， R^8 代表氯、溴、碘、氰基、Me、SMe、SOMe、 SO_2Me 、 CFH_2 、 CF_2H 或 CF_3 ， R^9 代表氫、甲基、乙基、丙-1-基、 CH_2CH_2OMe 或 $CH_2CH=CH_2$ ， R^{10} 代表式 E1 之基



其中符號定義如下且 # 代表連接至氮原子的點：

R^{11a} 代表氫或甲基，

R^{11b} 代表氫或 C_1-C_3 -烷基，

R^{11c} 代表氫、 C_1-C_4 -烷基、CN、 CH_2CN 、 $CH(Me)CN$ 、 $C(Me)_2CN$ 、 CH_2OH 、 $CH_2O-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $CH_2O-(C_1-C_3\text{-鹵烷基})$ 、 $C(Me)HOH$ 、 $C(Me)_2OH$ 、 $C(Me)HO-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $C(Me)_2O-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $C(Me)HO-(C_1-C_2\text{-鹵烷基})$ 、 $C(Me)_2O-(C_1-C_2\text{-鹵烷基})$ 、 $CH_2S-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $C(Me)HS-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、

$C(Me)_2S-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $Si(C_1-C_2\text{-烷基})_3$ 或 C_2-C_4 -烯基其是隨意地經鹵基或 CF_3 取代；

或

R^{10} 代表環戊基或環己基環其可隨意地經 CN、鹵基、 C_1-C_3 -烷基、 C_1-C_3 -烷氧基、 C_1-C_3 -鹵烷基、 C_1-C_3 -鹵烷氧基或 C_1-C_3 -烷氧基- C_1-C_3 -烷基單-或多取代，及這些化合物之農藝化學活性鹽類。

3. 根據申請專利範圍第 1 及 2 項之一項或兩項之式(I)化合物之用途，其中一或多個符號是定義如下：

X^1 代表氮或 CR^3 ，

X^2 代表氮或 CR^4 ，

其中 X^1 及 X^2 不都代表氮，

R^1 及 R^5 彼此獨立地代表氫、 C_1-C_2 -烷基、 C_1-C_2 -烷氧基、F 或 Cl，

R^2 代表氫、氟、氯、溴、碘、硝基、氰基、 C_1-C_3 -烷基、 C_1-C_2 -鹵烷基、羥基、 C_1-C_3 -烷氧基、 $OCH_2CH=CH_2$ 、 $OCH_2C\equiv CH$ 、 $OCONHMe$ 、 C_1-C_2 -鹵烷氧基、 $COMe$ 、 COH 、 $COEt$ 、 $CMe(=NOH)$ 、 $CMe(=NOMe)$ 、 SF_5 、 $S-(C_1-C_3)\text{-烷基}$ 、 SCF_3 、 SCF_2H 、 $SOMe$ 、 SO_2Me 、 $CO_2-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 NH_2 、 $NH-(C_1-C_2\text{-烷基})$ 、 $N-(C_1-C_2\text{-烷基})_2$ 、 $NHCO-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $NHCOH$ 、 $NMeCO-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $NHCO_2-(C_1-C_3\text{-烷基})$ ，

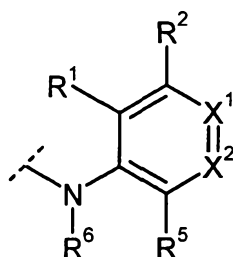
R^3 及 R^4 彼此獨立地代表氫、氟、氯、溴、碘、氰基、

硝基、羥基、O-(C₁-C₄-烷基)、O-環戊基、OCF₃、
 OCF₂H、OCF₂CF₃、OCF₂CF₂H、OCONH-(C₁-C₃-烷
 基)、OCON-(C₁-C₃-烷基)₂、OCO-(C₁-C₄-烷基)、SH、
 SF₅、S-C₁-C₃-烷基、SCF₃、SCF₂H、SPh、SOMe、
 SO₂Me、SO₂CH₂CH=CH₂、SO₂CH₂C≡CH、SO₂CF₃、
 SO₂NMe₂、甲醯基、CO-(C₁-C₄-烷基)、COCF₃、
 COCH₂CN、CONH-(C₁-C₄-烷基)、CON-(C₁-C₄-烷
 基)₂、CONHCH₂CF₃、CONHCH₂CH=CH₂、
 CONHCH₂C≡CH、CONHCH₂C(=CH₂)CH₃、
 CONHCH(CH₃)CH₂OCH₃、CONH(CH₂)₂OCH₃、
 CONHPh、CONH-環丙基、六氫吡啶-1-基羰基、嗎
 福啉-4-基羰基、(4-甲基六氫吡啶-1-基)羰基、
 COOH、(C₁-C₄-烷氧基)羰基、CO₂(CH₂)₂OCH₃、
 NHCO-(C₁-C₄-烷基)、NHCOCF₃、N(C₂H₅)COMe、
 NHCOCH=CH₂、NHCOPh、NHCOC(CH₃)₂CH₂F、
 NHCOC(CH₃)₂CH₂Cl、NHCO(C=CH₂)CH₃、
 NHCOCH₂OCH₃、NHCO(CH₂)₂OCH₃、
 N(CH₃)COCH₃、NHCHO、NMeCHO、NHCO₂-(C₁-C₄-
 烷基)、NHCO₂Ph、NHCO₂CH₂CH₂Cl、NMeCO₂Me、
 NH₂、NH-(C₁-C₄-烷基)、N-(C₁-C₂-烷基)₂、環丙基
 胺基、NHCH(CH₃)CH₂OCH₃、乙醯基(環丙基)胺基、
 [(1-甲基環丙基)羰基]胺基、嗎福啉-1-基、嗎福啉-4-
 基甲基、NHSO₂Me、CH₂CN、CHMeCN、
 CH₂SO₂NH-(C₁-C₄-烷基)、CH₂SO₂N-(C₁-C₄-烷基)₂、

$\text{C}(\text{Me})\text{HSO}_2\text{N}-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})_2$ 、 CH_2COCH_3 、
 $\text{CH}_2\text{COtertBu}$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)\text{COCH}_3$ 、 $\text{CH}_2\text{COCH}(\text{CH}_3)_2$ 、
 CH_2CO -環丙基、 $\text{CH}_2\text{CONHtertBu}$ 、 $\text{CH}_2\text{CO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基})$ 、 $\text{CH}_2\text{NHCOOMe}$ 、 $\text{CH}=\text{NOMe}$ 、 $\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NOMe}$ 、
 $\text{CH}=\text{NOEt}$ 、 $\text{C}(\text{CH}_3)=\text{NOEt}$ 、 CH_2NHAc 、
 $\text{CH}_2\text{NHCOCF}_3$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_4\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_3-\text{C}_6\text{-環烷基}$ 、1-甲氧基環丙基、1-氯環丙基、3,3-二甲基丁基、新戊基、
 $\text{C}_2-\text{C}_4\text{-烯基}$ 、 $\text{C}_1-\text{C}_2\text{-鹵烷基}$ 、嗎福啉-4-基磺醯基、
3-甲基-2,5-二酮基咪唑啉-1-基、3-甲基-2-酮基咪唑啉-1-基、(3-甲基-2-酮基咪唑啉-1-基)甲基、六氫吡啶-1-基磺醯基、1,3-噻唑-2-基、1,3-噻唑-4-基、3,5-二甲基六氫吡啶-1-基、4-(第三丁氧基羰基)六氫吡啶-1-基、5-乙氧基-3,4-二甲基-1H-吡啶-1-基、乙醯基(環己基)胺基、2-呋喃甲醯基胺基、(2,2,2-三氟乙基)胺磺醯基、5-乙氧基-3-(三氟甲基)-1H-吡啶-1-基、3-(2-氯乙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、1,1-二氧基異噻唑啉-2-基、1,1-二氧基四氫噻吩-2-基、4-甲基-5-酮基-4,5-二氫-1H-1,2,4-三唑-1-基、3-甲基-5-酮基-2,5-二氫-1H-吡啶-1-基、2-(甲氧基甲基)吡咯啉-1-基、2-酮基環戊基、2-酮基四氫呋喃-3-基、1-甲基-3-酮基-2,3-二氫-1H-吡啶-4-基、1-甲基-3-酮基吡啶-4-基、四氫呋喃-2-基、呋喃-2-基、5-甲基-1,1-二氧基-1,2,5-噻二唑啉-2-基、(2,2-二甲基丙醯基)(甲基)胺基、(二甲基胺磺醯基)甲基、(苄基胺磺

鹽基)甲基、(呋喃-2-基羰基)胺基、[(1-苯基乙基)胺
 磺鹽基]甲基、5-酮基-3-(丙-2-基)-4,5-二氫-1H-吡唑
 -1-基、5-酮基-3-(三氟甲基)-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、
 (環丙基羰基)胺基、4,4-二甲基-2,5-二酮基咪唑啉-1-
 基、3-(1-甲基乙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、3-(2-甲基
 丙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、2-酮基-3-丙-2-烯-1-基咪
 唑啉-1-基、3-第三丁基-2-酮基咪唑啉-1-基、吡咯啉
 -1-基磺鹽基、2,5-二酮基咪唑啉-4-基、(嗎福啉-4-
 基磺鹽基)甲基、(六氫吡啶-1-基磺鹽基)甲基、(吡
 咯啉-1-基磺鹽基)甲基、2-酮基咪唑啉-1-基、3-甲基
 -5-酮基-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、3,4-二甲基-5-酮基
 -4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、1-甲基環戊基、吡咯啉-1-
 基、六氫吡啶-1-基、2-酮基-2,5-二氫-1H-吡咯-1-基、
 3,3-二甲基-2-酮基環戊基、3-酮基-4,5-二甲基-2,4-
 二氫吡唑-2-基、3-酮基-4-乙基-5-甲基-2,4-二氫吡唑
 -2-基、3,5-二酮基-4-乙基吡唑啉-1-基、3-酮基-4,4-
 二甲基吡唑啉-1-基、2,5-二酮基-2,5-二氫-1H-吡咯
 -1-基、4-甲氧基-2-酮基-2,5-二氫-1H-吡咯-1-基、2-
 酮基-2,5-二氫-1H-吡咯-1-基、5-酮基-4,5-二氫-1H-
 咪唑-1-基、1,1-二氧基-1,2-噻吡-2-基、6-甲基-1,1-
 二氧基-1,2,6-噻二吡-2-基、環丙基(三氟乙鹽基)胺
 基,

而且, 如果 R^3 及 R^4 , 如果適當時經由 R^{12} 或 R^{13} 形成
 環, 下面通式(I)的次單元:



可以是(2-酮基-2,3-二氫-1H-吡啶-5-基)胺基、1H-吡啶-6-基胺基、1H-吡啶-5-基胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘧啶-6-基)胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘧啶-7-基)胺基、(1-乙醯基-2,3-二氫-1H-吡啶-6-基)胺基、(1-乙醯基-2,3-二氫-1H-吡啶-5-基)胺基、(2-酮基-2,3,4,5-四氫-1H-1-苯並吡啶-8-基)胺基、1,3-苯並二嘧啶-5-基胺基、(1,3-二酮基-2,3-二氫-1H-異吡啶-5-基)胺基、(2-酮基-2,3-二氫-1,3-苯並嘧啶-5-基)胺基、(2-乙基-1,3-苯並嘧啶-5-基)胺基、(2-酮基-1,3-苯並嘧啶-5-基)胺基、(2-酮基-1,2,3,4-四氫喹啉-6-基)胺基、(3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘧啶-6-基)胺基、(2-酮基-2,3-二氫-1,3-苯並嘧啶-6-基)胺基、[2-(乙基磺醯基)-1,3-苯並嘧啶-6-基]胺基、(2-甲基-1,3-苯並嘧啶-5-基)胺基、(2,2,3,3-四氟-2,3-二氫-1,4-苯並二氧芑-6-基)胺基、(3-酮基-1,3-二氫-2-苯並呋喃-5-基)胺基、(2,2-二氧基-1,3-二氫-2-苯並嘧啶-5-基)或(1-酮基-2,3-二氫-1H-茛-5-基)胺基，

R^6 代表氫、Me、乙基、丙基、甲醯基、 CH_2OCH_3 、 COMe 、 COCF_3 、 COOMe 、 COOEt 、 COOtertBu 、苄氧基羰

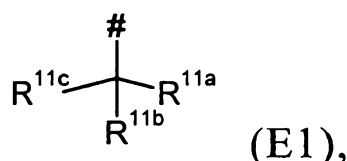
基、苄基、苯甲醯基或 2-甲基苯甲醯基，

R^7 代表氫、甲基或 CF_3 ，

R^8 代表氯、溴、 CF_3 、Me、氰基、碘、 CFH_2 、 CF_2H 、 SMe 、 $SOMe$ 或 SO_2Me ，

R^9 代表氫、甲基、乙基、丙-1-基、 CH_2CH_2OMe 或 $CH_2CH=CH_2$ ，

R^{10} 代表式 E1 之基



其中符號定義如下且 # 代表連接至氮原子的點：

R^{11a} 代表氫或甲基，

R^{11b} 代表氫或 C_1 - C_3 -烷基，

R^{11c} 代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、CN、 CH_2CN 、 $CH(Me)CN$ 、 CH_2OH 、 CH_2O -(C_1 - C_2 -烷基)、 CH_2O -(C_1 - C_2 -鹵烷基)、 $C(Me)HOH$ 、 $C(Me)_2OH$ 、 $C(Me)HO$ -(C_1 - C_2 -烷基)、 $C(Me)_2O$ -(C_1 - C_2 -烷基)、 CH_2S -(C_1 - C_2 -烷基)、 $C(Me)HS$ -(C_1 - C_2 -烷基)、 $C(Me)_2S$ -(C_1 - C_2 -烷基)、 $SiMe_3$ 或 C_2 - C_4 -烯基其是隨意地經鹵基或 CF_3 取代；

或

R^{10} 代表環戊基或環己基環其可隨意地經 CN、鹵基、Me、Et、OMe、 CF_3 、 OCF_3 、 CH_2OCH_3 單-或多取代，及這些化合物之農藝化學活性鹽類。

4. 根據申請專利範圍第 1 至 3 項之一或多項之式(I)化合物之用

途，其中一或多個符號定義如下：

X^1 代表 CR^3 ，

X^2 代表氮或 CR^4 ，

R^1 及 R^5 彼此獨立地代表氫、甲基、甲氧基或 F，

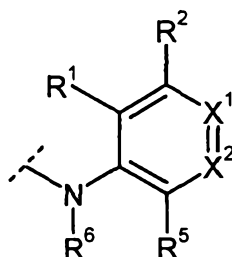
R^2 代表氫、氟、氯、溴、氰基、甲基、乙基、丙基、丙-2-基、 CF_3 、羥基、OMe、OEt、 OCF_3 、COMe、COEt、SMe、SEt、 CO_2CH_3 、 CO_2Et 、NHMe、 NMe_2 、NEt、 NEt_2 或 NHCOMe，

R^3 及 R^4 彼此獨立地代表氫、氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、羥基、OMe、OEt、OPr、OisoPr、OBu、OsecBu、OisoBu、OtertBu、O-環戊基、 OCF_3 、 OCF_2CF_3 、 OCF_2CF_2H 、OCONHMe、OCONHEt、OCONHPr、OCONHisoPr、OCONMe₂、OCONEt₂、OCONPr₂、OCONisoPr₂、OCOME、OCOEt、OCOBu、SH、SF₅、SMe、SEt、SPr、SiPr、SCF₃、SCF₂H、SPh、SO₂Me、SO₂CF₃、SO₂NMe₂、甲醯基、COMe、COEt、COPr、COisoPr、COCF₃、COCH₂CN、CONHMe、CONMe₂、CONHEt、CONHCH₂CF₃、CONEt₂、CONHPr、CONHisoPr、CONHBu、CONHtertBu、CONHCH₂CH=CH₂、CONHCH₂C≡CH、CONHCH₂C(=CH₂)CH₃、CONHCH(CH₃)CH₂OCH₃、CONH(CH₂)₂OCH₃、CONHPh、CONH-環丙基、六氫吡啶-1-基羰基、嗎福啉-4-基羰基、COOH、CO₂CH₃、CO₂Et、CO₂Pr、CO₂isoPr、CO₂(CH₂)₂OCH₃、

NHCOMe、NHCOEt、NHCOPr、NHCO*iso*Pr、
 NHCObu、NHCO*iso*Bu、NHCOCF₃、NHCO*sec*Bu、
 NHCOT*ert*Bu、N(C₂H₅)COMe、NHCOCH=CH₂、
 NHCOPh、NHCOC(CH₃)₂CH₂F、
 NHCOC(CH₃)₂CH₂Cl、NHCO(C=CH₂)CH₃、
 NHCOCH₂OCH₃、NHCO(CH₂)₂OCH₃、
 N(CH₃)COCH₃、NHCHO、NMeCHO、NHCO₂Me、
 NHCO₂Et、NHCO₂*iso*Pr、NHCO₂*tert*Bu、
 NHCO₂*iso*Bu、NHCO₂*sec*Bu、NHCO₂*n*Bu、NHCO₂Ph、
 NHCO₂CH₂CH₂Cl、NMeCO₂Me、NH₂、NHMe、NMe₂、
 NEt、NEt₂、NHPr、NH*iso*Pr、NH*n*Bu、環丙基胺
 基、NHCH(CH₃)CH₂OCH₃、乙醯基(環丙基)胺基、
 [(1-甲基環丙基)羰基]胺基、嗎福啉-1-基、嗎福啉-4-
 基甲基、NHSO₂Me、CH₂CN、CHMeCN、
 CH₂SO₂NHMe、CH₂SO₂NHPr、CH₂COCH₃、
 CH₂CO*tert*Bu、CH(CH₃)COCH₃、CH₂COCH(CH₃)₂、
 CH₂CO-環丙基、CH₂CONH*tert*Bu、CH₂CO₂Et、
 CH₂CO₂Me、CH₂NHCOOMe、CH₂NHAc、
 CH₂NHCOCF₃、甲基、乙基、丙基、1-甲基乙基、
 丁基、1-甲基丙基、2-甲基丙基、1,1-二甲基乙基、
 環丙基、1-甲氧基環丙基、1-氯環丙基、環丁基、
 3-二甲基丁基、環戊基、環己基、新戊基、丙-2-烯
 -1-基、1-甲基丙-2-烯-1-基、丁-3-烯-1-基、CF₃、
 CF₂H、嗎福啉-4-基磺醯基、3-甲基-2,5-二酮基咪唑

啉-1-基、3-甲基-2-酮基咪唑啉-1-基、(3-甲基-2-酮基咪唑啉-1-基)甲基、六氫吡啉-1-基磺醯基、1,3-噻唑-2-基、1,3-噻唑-4-基、3,5-二甲基六氫吡啉-1-基、4-(第三丁氧基羰基)六氫吡啉-1-基、乙醯基(環己基)胺基、2-呋喃甲醯基胺基-3-甲基-5-酮基-2,5-二氫-1H-吡唑-1-基、四氫呋喃-2-基、呋喃-2-基、5-甲基-1,1-二氧基-1,2,5-噻二唑啉-2-基、(2,2-二甲基丙醯基)(甲基)胺基、(苄基胺磺醯基)甲基、(二甲基胺磺醯基)甲基、(呋喃-2-基羰基)胺基、[(1-苯基乙基)胺磺醯基]甲基、[乙基(甲基)胺磺醯基]甲基、[甲基(丙-2-基)胺磺醯基]甲基、5-酮基-3-(丙-2-基)-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、5-酮基-3-(三氟甲基)-4,5-二氫-1H-吡唑-1-基、(環丙基羰基)胺基、3-(1-甲基乙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、3-(2-甲基丙基)-2-酮基咪唑啉-1-基、2-酮基-3-丙-2-烯-1-基咪唑啉-1-基、3-第三丁基-2-酮基咪唑啉-1-基、吡咯啉-1-基磺醯基、2,5-二酮基咪唑啉-4-基、(嗎福啉-4-基磺醯基)甲基、(六氫吡啉-1-基磺醯基)甲基、(吡咯啉-1-基磺醯基)甲基、2-酮基咪唑啉-1-基、3,3-二甲基-2-酮基環戊基、3-酮基-4,5-二甲基-2,4-二氫吡唑-2-基、3,5-二酮基-4-乙基吡唑啉-1-基、5-酮基-4,5-二氫-1H-咪唑-1-基、1,1-二氧基-1,2-噻吡啉-2-基、6-甲基-1,1-二氧基-1,2,6-噻二吡啉-2-基、環丙基(三氟乙醯基)胺基,

而且，如果 R^3 及 R^4 ，如果適當時經由 R^{12} 或 R^{13} 形成環，下面通式(I)的次單元：



可代表(2-酮基-2,3-二氫-1H-吡啶-5-基)胺基、1H-吡啶-6-基胺基、1H-吡啶-5-基胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔吩-6-基)胺基、(4-甲基-3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔吩-7-基)胺基、(1-乙醯基-2,3-二氫-1H-吡啶-6-基)胺基、(1-乙醯基-2,3-二氫-1H-吡啶-5-基)胺基、(2-酮基-2,3,4,5-四氫-1H-1-苯並吡啶-8-基)胺基、1,3-苯並二嘔茂-5-基胺基、(2-酮基-1,3-苯並嘔噻-5-基)胺基、(2-酮基-1,2,3,4-四氫喹啉-6-基)胺基、(3-酮基-3,4-二氫-2H-1,4-苯並嘔吩-6-基)胺基、(2-酮基-2,3-二氫-1,3-苯並嘔啞-6-基)胺基、(2-甲基-1,3-苯並嘔啞-5-基)胺基、(2,2,3,3-四氟-2,3-二氫-1,4-苯並二氧芑-6-基)胺基、(3-酮基-1,3-二氫-2-苯並呋喃-5-基)胺基、1-酮基-2,3-二氫-1H-茛-5-基)胺基，

R^6 代表氫、Me、甲醯基或 COMe，

R^7 代表氫，

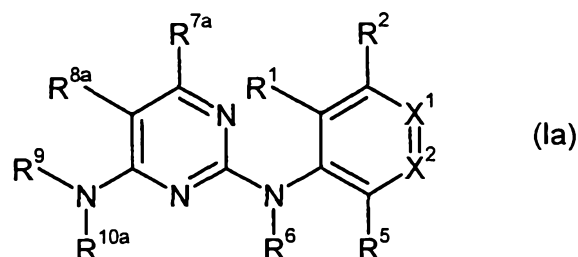
R^8 代表氯、溴、 CF_3 、Me、氰基、碘或 CFH_2 ，

R^9 代表氫、甲基、乙基、丙-1-基、 CH_2CH_2OMe 或 $CH_2CH=CH_2$ ，

R^{10} 代表甲基、乙基、丙基、丙-2-基、丁基、丁-2-基、2-甲基丙基、第三丁基、戊基、3-甲基丁基、2-甲基丁基、2,2-二甲基丙基、戊-2-基、戊-3-基、4-甲基戊-2-基、己-3-基、3,3-二甲基丁-2-基、2,4-二甲基戊-3-基、環戊基、2-甲基環戊基、2-乙基環戊基、2-氯環戊基、2-氟環戊基、2-氰基環戊基、2-甲氧基環戊基、2-(甲氧基甲基)環戊基、環己基、2-甲氧基環己基、2-甲基環己基、4,4-二氟環己基、4-(三氟甲基)環己基、丙-2-烯-1-基、2-甲基丙-2-烯-1-基、1-甲基丙-2-烯-1-基、3-甲基丁-2-烯-1-基、丁-2-烯-1-基、4,4,4-三氟丁-2-烯-1-基、3-氯丁-2-烯-1-基、2-氯丙-2-烯-1-基、氰基甲基、2-氰基乙基、1-氰基丙-2-基、3-氰基丁-2-基、(三甲基矽烷基)甲基、1-(三甲基矽烷基)乙基、2-羥基乙基、2-甲氧基乙基、2-乙氧基乙基、2-(三氟甲氧基)乙基、1-羥基丙-2-基、1-羥基丁-2-基、3-羥基-3-甲基丁-2-基、2-羥基-2-甲基丙基、3-甲氧基-3-甲基丁-2-基、2-甲氧基-2-甲基丙基、1-甲氧基丙-2-基、1-乙氧基丙-2-基、1-三氟甲氧基丙-2-基、1-甲氧基丁-2-基、3-甲氧基丁-2-基、1-甲氧基-3-甲基丁-2-基、1-甲氧基戊-2-基、2-(甲基胺磺醯基)乙基、(2R)-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基、(2S)-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基、2-甲基-1-(甲基胺磺醯基)丙-2-基，

及其農藝化學活性鹽類。

5. 一種式(Ia)之化合物：



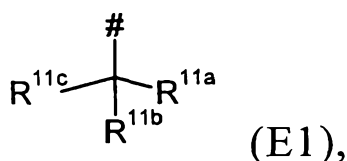
其中

X^1 、 X^2 、 R^1 至 R^6 、 R^9 、 R^{12} 及 R^{13} 具有申請專利範圍第1項之定義，

R^{7a} 代表氫、 C_2 - C_3 -烷基、氰基或 C_1 - C_3 -鹵烷基，

R^{8a} 代表氯、碘、SMe、SOMe、 SO_2Me 、 CCl_3 、 CFH_2 或 CF_2H ，

R^{10a} 代表下式之 E1 基團



其中符號定義如下且 # 代表連接至氮原子的點：

R^{11a} 代表氫或甲基，

R^{11b} 代表氫或 C_1 - C_3 -烷基，

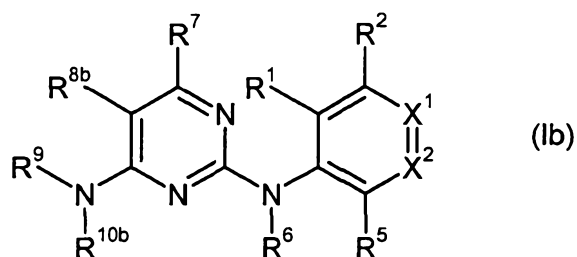
R^{11c} 代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、CN、 CH_2CN 、 $CH(Me)CN$ 、 $C(Me)_2CN$ 、 $CH_2O-(C_1-C_3-烷基)$ 、 $CH_2O-(C_1-C_3-鹵烷基)$ 、 $C(Me)_2OH$ 、 $C(Me)HO-(C_1-C_3-烷基)$ 、 $C(Me)_2O-(C_1-C_3-烷基)$ 、 $C(Me)HO-(C_1-C_3-鹵烷基)$ 、 $C(Me)_2O-(C_1-C_3-鹵烷基)$ 、 $CH_2S-(C_1-C_3-烷基)$ 、 $C(Me)HS-(C_1-C_3-烷基)$ 、 $C(Me)_2S-(C_1-C_3-烷基)$ 、

Si-(C₁-C₂-烷基)₃ 或 C₂-C₄-烯基其隨意地經鹵基或 CF₃ 取代,

或

R^{11c} 代表環戊基或環己基環其隨意地經 CN、鹵基、C₁-C₃-烷基、C₁-C₃-烷氧基、C₁-C₃-鹵烷基、C₁-C₃-鹵烷氧基、C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基取代, 及這些化合物之農藝化學活性鹽類。

6. 一種式(Ib)之化合物：

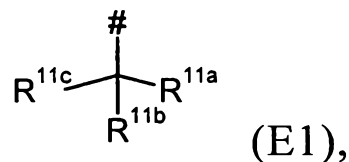


其中

X¹、X²、R¹至R⁷、R⁹、R¹²及R¹³具有申請專利範圍第1項之定義,

R^{8b}代表CF₃,

R^{10b}代表下式之 E1 基團



其中符號定義如下且 # 代表連接至氮原子的點：

R^{11a} 代表氫或甲基，

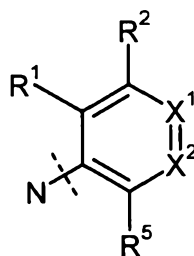
R^{11b} 代表氫或 C_1 - C_3 -烷基，

R^{11c} 代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、CN、 CH_2CN 、 $CH(Me)CN$ 、 $C(Me)_2CN$ 、 $CH_2O-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $CH_2O-(C_1-C_3\text{-鹵烷基})$ 、 $C(Me)_2OH$ 、 $C(Me)HO-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $C(Me)_2O-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $C(Me)HO-(C_1-C_3\text{-鹵烷基})$ 、 $C(Me)_2O-(C_1-C_3\text{-鹵烷基})$ 、 $CH_2S-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $C(Me)HS-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $C(Me)_2S-(C_1-C_3\text{-烷基})$ 、 $Si-(C_1-C_2\text{-烷基})_3$ 或 C_2 - C_4 -烯基其隨意地經鹵基或 CF_3 取代，

或

R^{11c} 代表環戊基或環己基環其隨意地經 CN、鹵基、 C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_3 -烷氧基、 C_1 - C_3 -鹵烷基、 C_1 - C_3 -鹵烷氧基、 C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基取代；

不包括其中在下面通式(Ib)之次單元中



X^1 代表 CR^3 且 X^2 代表 CR^4 且

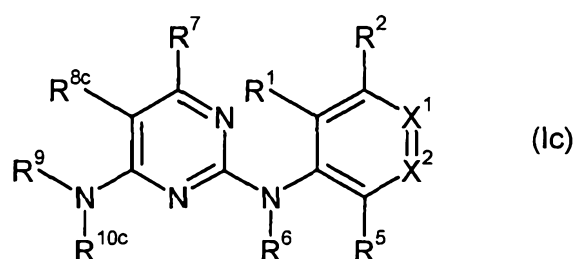
R^3 及 R^4 一起與苯基環形成 *1H*-2-羥基吡啶-5-基或 *1H*-2-羥基吡啶-6-基；

或 R^3 代表 $\text{CON}(R^{12})_2$ 且另兩個 R^{12} 一起與和其連結之
氮原子形成 4-甲基-1,4-六氫吡啶基；

或 R^2 及 R^3 或 R^3 及 R^4 代表氯；

及這些化合物之農藝化學活性鹽類。

7. 一種式(Ic)之化合物：

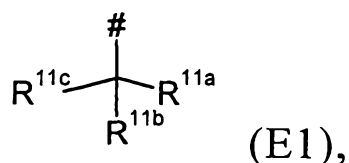


其中

X^1 、 X^2 、 R^1 至 R^7 、 R^9 、 R^{12} 及 R^{13} 具有申請專利範圍第1項
之定義，

R^{8c} 代表溴且

R^{10c} 代表下式之 E1 基團



其中符號定義如下且 # 代表連接至氮原子的點：

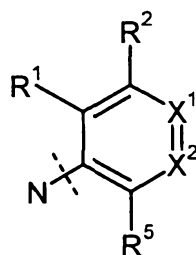
R^{11a} 代表氫或甲基，

R^{11b} 代表氫或 C_1 - C_3 -烷基，

R^{11c} 代表氫、 C_1 - C_4 -烷基、 CN 、 CH_2CN 、 $CH(Me)CN$ 、 $C(Me)_2CN$ 、 CH_2O -(C_1 - C_3 -烷基)、 CH_2O -(C_1 - C_3 -鹵烷基)、 $C(Me)_2OH$ 、 $C(Me)HO$ -(C_1 - C_3 -烷基)、 $C(Me)_2O$ -(C_1 - C_3 -烷基)、 $C(Me)HO$ -(C_1 - C_3 -鹵烷基)、 $C(Me)_2O$ -(C_1 - C_3 -鹵烷基)、 CH_2S -(C_1 - C_3 -烷基)、 $C(Me)HS$ -(C_1 - C_3 -烷基)、 $C(Me)_2S$ -(C_1 - C_3 -烷基)、 Si -(C_1 - C_2 -烷基)₃ 或 C_2 - C_4 -烯基其隨意地經鹵基或 CF_3 取代，

或

R^{11c} 代表環戊基或環己基環其隨意地經 CN 、鹵基、 C_1 - C_3 -烷基、 C_1 - C_3 -烷氧基、 C_1 - C_3 -鹵烷基、 C_1 - C_3 -鹵烷氧基、 C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基取代；
不包括其中在下面通式(Ic)之次單元中



X^1 代表 CR^3 且 X^2 代表 CR^4 且

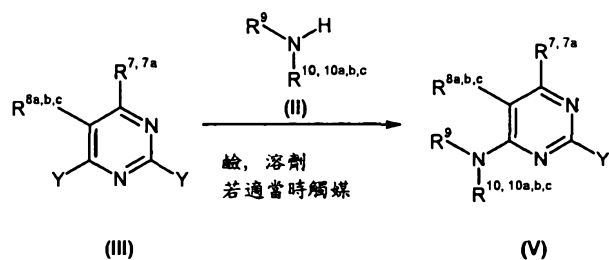
R^3 及 R^4 一起與苯基環形成 *1H*-2-羥基吡啶-5-基或 *1H*-吡啶-5-基胺基；

或 R^3 代表 H 、 SMe 、 $SOMe$ 、 SO_2NMe_2 、六氫吡啶-1-基、4-第三丁氧基羰基六氫吡啶-1-基或(吡咯啉-1-基)甲基；

或 R^2 或 R^4 代表 SMe ；

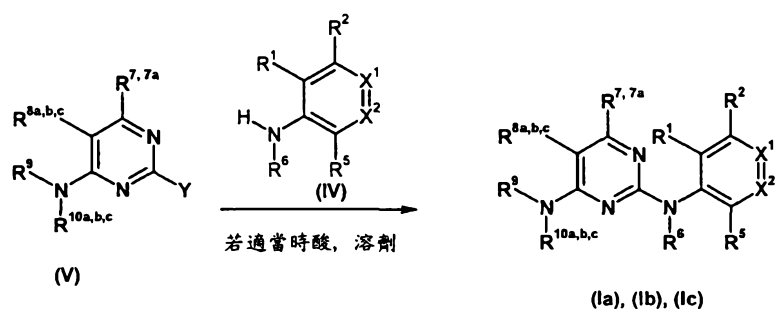
及這些化合物之農藝化學活性鹽類。

8. 一種控制植物致病性有害真菌之組成物，其特徵是含有至少一種選自根據申請專利範圍第5、6或7項中任一項之式(Ia)、(Ib)及(Ic)之二胺基嘧啶類，以及延伸劑及/或表面活性劑。
9. 一種根據申請專利範圍第5、6或7項中任一項之式(Ia)、(Ib)及(Ic)之二胺基嘧啶類用於控制植物致病性有害真菌之用途。
10. 一種用於控制植物致病性有害真菌之方法，其特徵是將選自根據申請專利範圍第5、6或7項中任一項之式(Ia)、(Ib)及(Ic)之二胺基嘧啶類施加在植物致病性有害真菌及/或其住所。
11. 一種製備用於控制植物致病性有害真菌之組成物之方法，其特徵是將選自根據申請專利範圍第5、6或7項中任一項之式(Ia)、(Ib)及(Ic)之二胺基嘧啶類與延伸劑及/或表面活性劑混合。
12. 一種製備根據本發明之式(Ia)、(Ib)及(Ic)之二胺基嘧啶類之方法，其包括下面至少一個步驟(a)至(f)：
 - (a)根據下面的反應圖式，將式(III)之2,4-二鹵基嘧啶與式(II)之胺在鹼存在下，如果適當時在溶劑存在下，如果適當時在觸媒存在下，反應而得到式(V)之化合物：



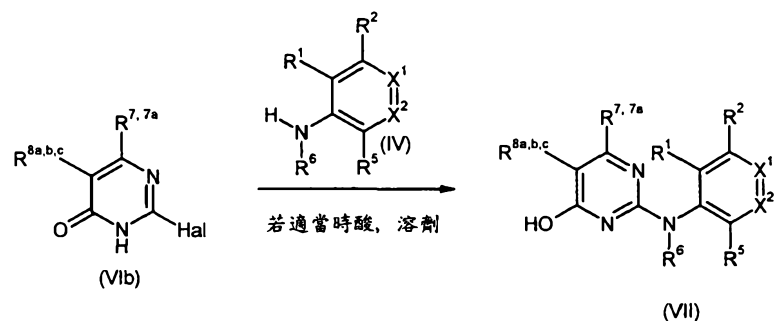
其中 Y = F、Cl、Br、I

(b)根據下面的反應圖式，將式(V)之化合物與式(IV)之(雜)芳族胺如果適當時在酸存在下，如果適當時在溶劑存在下反應：



其中 Y = F、Cl、Br、I

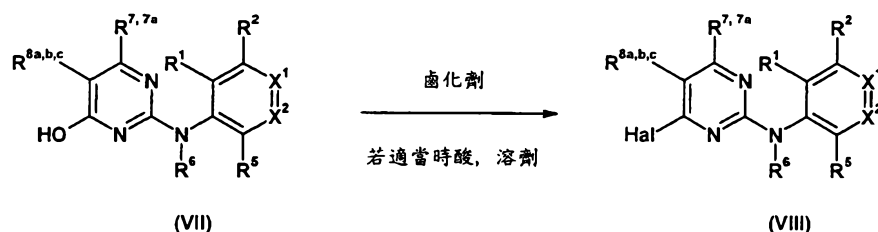
(c)根據下面的反應圖式，將式(VIb)之化合物與式(IV)之(雜)芳族胺如果適當時在酸存在下且如果適當時在溶劑存在下反應：



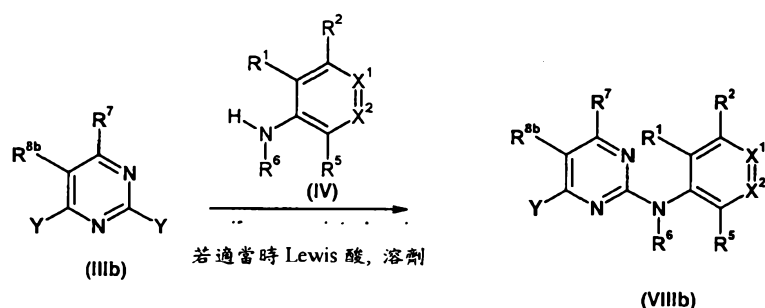
其中 Hal = F、Cl、Br、I

(d)根據下面的反應圖式，將式(VII)之化合物與鹵化劑如果適當時在溶劑存在下反應而得到式(VIII)之化

合物：

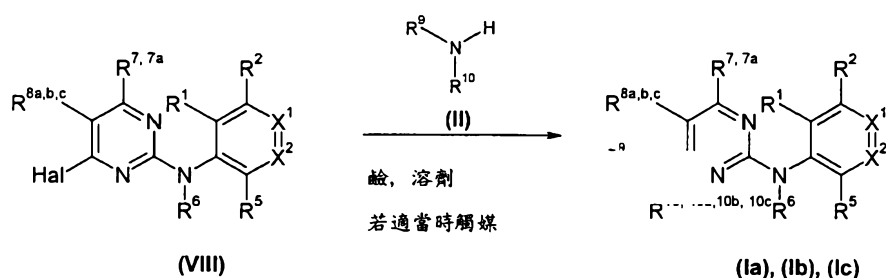


(e)根據下面的反應圖式,將式(VIIIb)之化合物與式(IV)之(雜)芳族胺如果適當時在觸媒存在下且如果適當時在溶劑存在下反應：



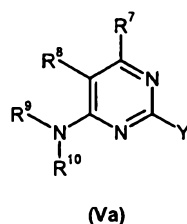
其中 $Y = F, Cl, Br, I$ 且 $R^{8b} = CF_3$

(f)根據下面的反應圖式,將式(VIII)之化合物與式(II)之胺在鹼存在下,如果適當時在溶劑存在下,如果適當時在觸媒存在下,反應而得到式(Ia、Ib 及 Ic)之化合物：



其中在上面圖式之 R^1 至 R^{10} 及 X^1 與 X^2 基團之定義對應至申請專利範圍第 1 項之定義且 Y 及 Hal 代表 F, Cl, Br, I 。

13. 一種式(Va)之化合物：



其中

R^7 代表氫，

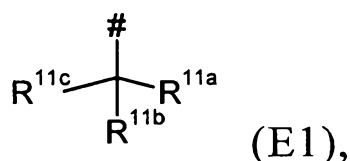
R^8 代表氯、碘、SMe、SOMe、SO₂Me、CF₃、CCl₃、CFH₂ 或 CF₂H，

R^9 具有上述的一般、較佳、特別較佳及非常特別較佳的意義，

Y = F、Cl、Br 或 I

且

R^{10} 代表下式之 E1 基



其中符號定義如下且 # 代表連接至氮原子的點：

R^{11a} 代表氫或甲基，

R^{11b} 代表氫或 C₁-C₃-烷基，

R^{11c} 代表 C₂-C₄-烷基、CN、CH₂CN、CH(Me)CN、C(Me)₂CN、CH₂O-(C₁-C₃-烷基)、CH₂O-(C₁-C₃-鹵烷基)、C(Me)₂OH、C(Me)HO-(C₁-C₃-烷基)、C(Me)₂O-(C₁-C₃-烷基)、C(Me)HO-(C₁-C₃-鹵烷基)、C(Me)₂O-(C₁-C₃-鹵烷基)、CH₂S-(C₁-C₃-烷基)、

$\text{C}(\text{Me})\text{HS}-(\text{C}_1\text{-C}_3\text{-烷基})$ 、 $\text{C}(\text{Me})_2\text{S}-(\text{C}_1\text{-C}_3\text{-烷基})$ 、
 $\text{Si}-(\text{C}_1\text{-C}_2\text{-烷基})_3$ 或 $\text{C}_2\text{-C}_4\text{-烯基}$ 其隨意地經鹵基或
 CF_3 取代，

或

R^{11c} 代表環戊基環其可隨意地經 CN 、鹵基、 $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-烷氧基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-鹵烷基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-鹵烷氧基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-烷氧基-C}_1\text{-C}_3\text{-烷基單-或多}$ 取代，

或

R^{11c} 代表環己基環其至少經一個選自 CN 、鹵基、 $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-烷基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-烷氧基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-鹵烷基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-鹵烷氧基}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_3\text{-烷氧基-C}_1\text{-C}_3\text{-烷基之基團}$ 取代。

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：

無

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

