

- (21) 申請案號：106107562 (22) 申請日：中華民國 106 (2017) 年 03 月 08 日
- (51) Int. Cl. : C07D215/14 (2006.01) C07D215/36 (2006.01)  
A01N43/42 (2006.01) A01P3/00 (2006.01)
- (30) 優先權：2016/03/10 歐洲專利局 16159707.5  
2017/02/01 歐洲專利局 17154212.9
- (71) 申請人：先正達合夥公司 (瑞士) SYNGENTA PARTICIPATIONS AG (CH)  
瑞士
- (72) 發明人：維斯 馬賽亞斯 WEISS, MATTHIAS (CH)；保 漢丹 法漢 BOU HAMDAN,  
FARHAN (LB)；括倫塔 蘿拉 QUARANTA, LAURA (IT)
- (74) 代理人：閻啟泰；林景郁
- 申請實體審查：無 申請專利範圍項數：16 項 圖式數：0 共 146 頁

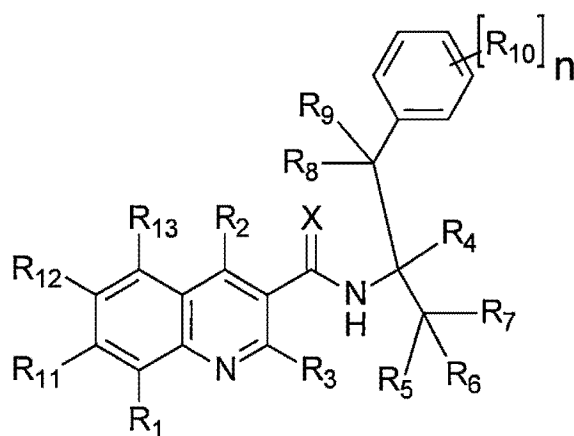
## (54) 名稱

殺微生物的喹啉 (硫代) 羧醯胺衍生物

MICROBIOCIDAL QUINOLINE (THIO) CARBOXAMIDE DERIVATIVES

## (57) 摘要

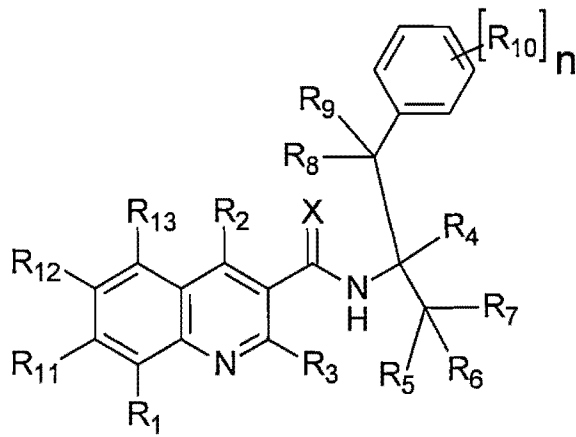
揭露了具有化學式(I)之化合物



(I)

其中該等取代基係如申請專利範圍第 1 項中所定義的。此外，本發明涉及包括具有化學式(I)之化合物的農用化學品組成物，涉及該等組成物的製備，並且涉及該等化合物或組成物在農業或園藝學中用於對抗、預防或控制致植物病的微生物、特別是真菌對植物、收穫的糧食作物、種子或非生命材料的侵染之用途。

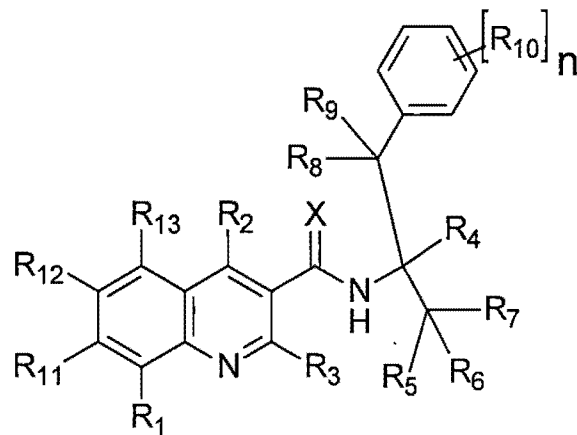
Compounds of the formula (I)



(I)

wherein the substituents are as defined in claim 1. Furthermore, the present invention relates to agrochemical compositions which comprise compounds of formula (I), to preparation of these compositions, and to the use of the compounds or compositions in agriculture or horticulture for combating, preventing or controlling infestation of plants, harvested food crops, seeds or non-living materials by phytopathogenic microorganisms, in particular fungi.

特徵化學式：



(I)

## 發明摘要

※ 申請案號： 106107562

※ 申請日： 106/03/08

 ※IPC 分類： *C07D 215/14* (2006.01)  
*C07D 215/36* (2006.01)  
*A01N 43/42* (2006.01)  
*A01P 3/00* (2006.01)

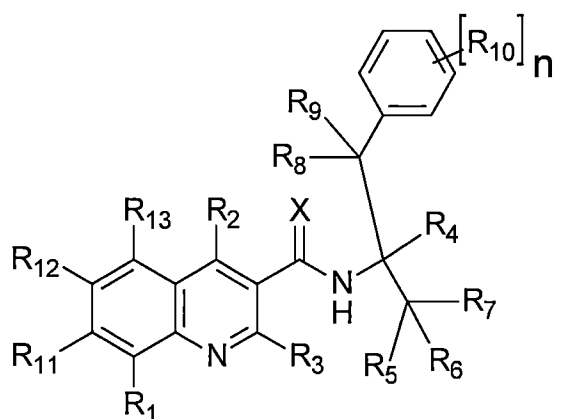
## 【發明名稱】(中文/英文)

殺微生物的喹啉(硫代)羧醯胺衍生物

MICROBIOCIDAL QUINOLINE (THIO)CARBOXAMIDE DERIVATIVES

## 【中文】

揭露了具有化學式 (I) 之化合物

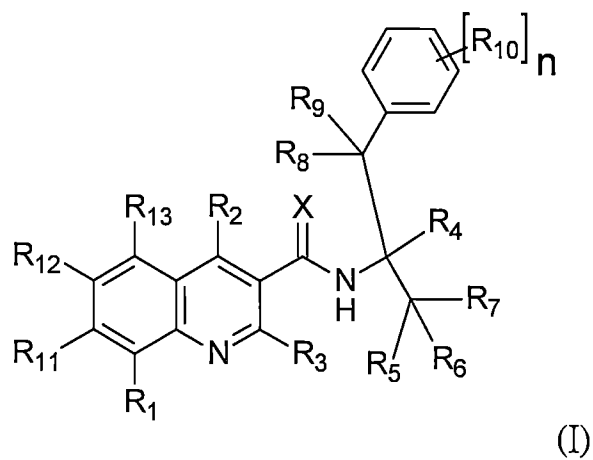


(I)

其中該等取代基係如申請專利範圍第 1 項中所定義的。此外，本發明涉及包括具有化學式 (I) 之化合物的農用化學品組成物，涉及該等組成物的製備，並且涉及該等化合物或組成物在農業或園藝學中用於對抗、預防或控制致植物病的微生物、特別是真菌對植物、收穫的糧食作物、種子或非生命材料的侵染之用途。

## 【英文】

Compounds of the formula (I)



wherein the substituents are as defined in claim 1. Furthermore, the present invention relates to agrochemical compositions which comprise compounds of formula (I), to preparation of these compositions, and to the use of the compounds or compositions in agriculture or horticulture for combating, preventing or controlling infestation of plants, harvested food crops, seeds or non-living materials by phytopathogenic microorganisms, in particular fungi.

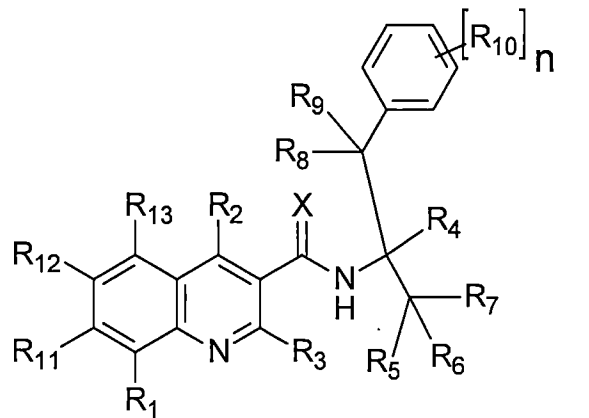
**【代表圖】**

**【本案指定代表圖】**：無。

**【本代表圖之符號簡單說明】**：

無

**【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】**：



(I)

# 發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

## 【發明名稱】(中文/英文)

殺微生物的喹啉(硫代)羧醯胺衍生物

MICROBIOCIDAL QUINOLINE (THIO)CARBOXAMIDE DERIVATIVES

## 【技術領域】

【0001】 本發明涉及殺微生物的喹啉(硫代)羧醯胺衍生物，例如，作為活性成分，該喹啉(硫代)羧醯胺衍生物具有殺微生物、特別是殺真菌的活性。本發明還涉及該等喹啉(硫代)羧醯胺衍生物的製備，涉及在該等喹啉(硫代)羧醯胺衍生物的製備中有用的中間體，涉及該等中間體之製備，涉及包括該等喹啉(硫代)羧醯胺衍生物中至少一種的農用化學品組成物，涉及該等組成物的製備並且涉及該等喹啉(硫代)羧醯胺衍生物或組成物在農業或園藝學中用於控制或預防致植物病的微生物、特別是真菌對植物、收穫的糧食作物、種子或非生命材料的侵染之用途。

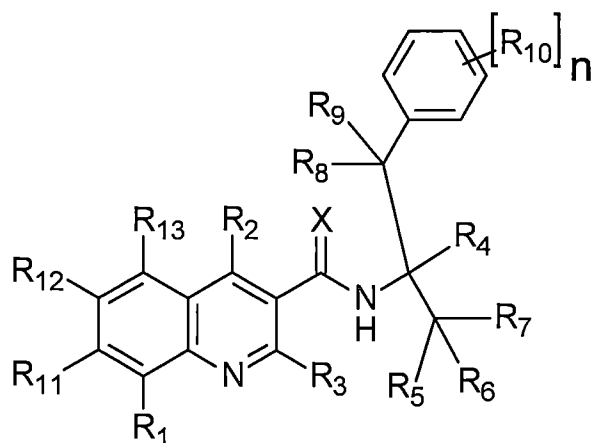
## 【先前技術】

【0002】 某些殺真菌的喹啉(硫代)羧醯胺化合物描述於 WO 04039783 中。

## 【發明內容】

【0003】 現在已經出人意料地發現某些新穎的喹啉(硫代)羧醯胺衍生物具有有利的殺真菌特性。

【0004】 因此本發明提供了具有化學式 (I) 之化合物



(I)

其中

X 係 O 或 S；

R<sub>1</sub> 係氫、鹵素、甲基、甲氧基或氰基；

R<sub>2</sub> 和 R<sub>3</sub> 各自獨立地是氫、鹵素或甲基；

R<sub>4</sub> 係氫、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、或 C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> 環烷基，其中該烷基和環烷基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基硫基；

R<sub>5</sub> 和 R<sub>6</sub> 各自獨立地選自氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基硫基；或

R<sub>5</sub> 和 R<sub>6</sub> 與它們所附接的碳原子一起代表 C=O、C=NOR<sub>c</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 環烷基或 C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 烯基，其中該環烷基和烯基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基硫基；

R<sub>7</sub> 係氫、C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 環烯基、或 C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 炔基，其中該烷基、環烷基、烯基、炔基、環烯基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 4 個取代基取代：鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷氧基、羥基和 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基硫基；

$R_8$  和  $R_9$  各自獨立地選自氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基和  $C_1$ - $C_4$  烷氧基；或

$R_8$  和  $R_9$  與它們所附接的碳原子一起代表  $C_3$ - $C_5$  環烷基，其中該環烷基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_1$ - $C_3$  烷氧基和  $C_1$ - $C_3$  烷基硫基；

每個  $R_{10}$  獨立地代表鹵素、硝基、氰基、甲醯基、 $C_1$ - $C_5$  烷基、 $C_2$ - $C_5$  烯基、 $C_2$ - $C_5$  炔基、 $C_3$ - $C_6$  環烷基、 $C_1$ - $C_5$  烷氧基、 $C_3$ - $C_5$  烯基氧基、 $C_3$ - $C_5$  炔基氧基、 $C_1$ - $C_5$  烷基硫基、 $-C(=NOR_c)C_1$ - $C_5$  烷基、或  $C_1$ - $C_5$  烷基羰基，其中該烷基、環烷基、烯基、炔基、烷氧基、烯基氧基、炔基氧基和烷基硫基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 5 個取代基取代：鹵素、 $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_1$ - $C_3$  烷氧基、氰基和  $C_1$ - $C_3$  烷基硫基； $n$  係 0、1、2、3、4 或 5；

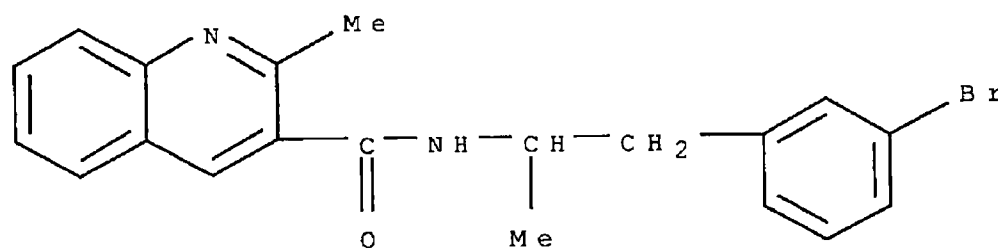
每個  $R_c$  獨立地選自氫、 $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_2$ - $C_4$  烯基、 $C_3$ - $C_4$  炔基、 $C_3$ - $C_4$  環烷基 ( $C_1$ - $C_2$ ) 烷基和  $C_3$ - $C_4$  環烷基，其中該烷基、環烷基、烯基和炔基基團可以視情況被獨立地選自鹵素和氰基的 1 至 3 個取代基取代；

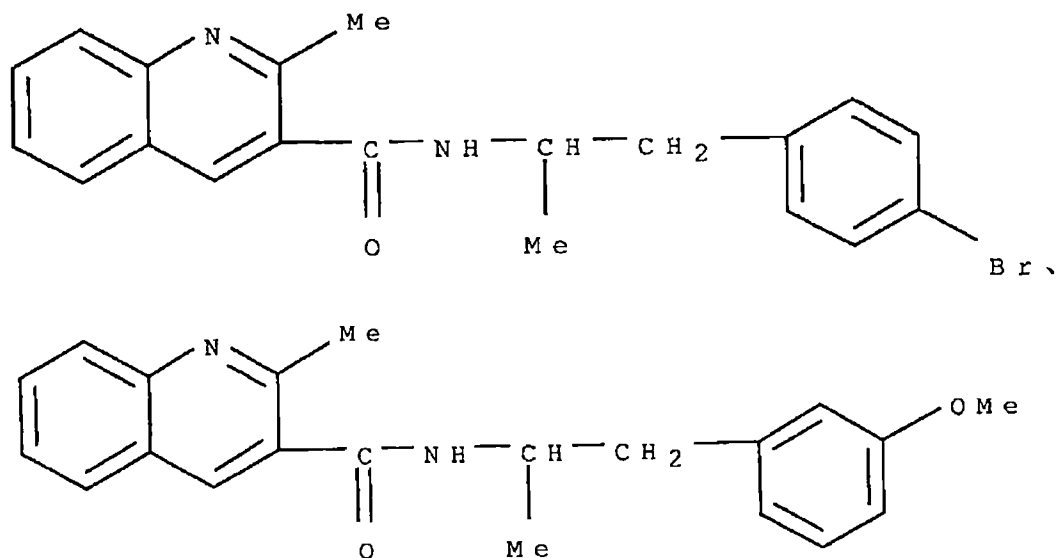
$R_{11}$  係氫、鹵素、甲基、甲氧基或氰基；

$R_{12}$  和  $R_{13}$  各自獨立地選自氫、鹵素、甲基、甲氧基或羥基；

及其鹽和/或 N-氧化物；

其條件係該化合物不是以下化合物之一：





【0005】 在第二方面，本發明提供了如下農用化學品組成物，該組成物包括具有化學式 (I) 之化合物。

【0006】 具有化學式 (I) 之化合物可以用於控制致植物病的微生物。因此，為了控制植物病原體，可以將根據本發明所述的具有化學式 (I) 之化合物、或包括具有化學式 (I) 之化合物的組成物直接施用到該植物病原體、或植物病原體的場所，特別是易受植物病原體攻擊的植物。

【0007】 因此，在第三方面，本發明提供了如在此描述的具有化學式 (I) 之化合物、或包括具有化學式 (I) 之化合物的組成物用以控制植物病原體之用途。

【0008】 在另外的方面，本發明提供了控制植物病原體之方法，該方法包括將如在此所描述的具有化學式 (I) 之化合物、或包括具有化學式 (I) 之化合物的組成物施用到所述植物病原體、或所述植物病原體的場所，特別是易受植物病原體攻擊的植物。

【0009】 具有化學式 (I) 之化合物在控制致植物病的真菌上係特別有效的。

【0010】 因此，在又另外的方面，本發明提供了如在此描述的具有化學式 (I) 之化合物、或包括具有化學式 (I) 之化合物的組成物用以控制致植物病的真菌之用途。

【0011】 在另外的方面，本發明提供了控制致植物病的真菌的方法，該方法包括將如在此所描述的具有化學式 (I) 之化合物、或包括具有化學式 (I) 之化合物的組成物施用到所述致植物病的真菌、或所述致植物病的真菌的場所、特別是易受致植物病的真菌攻擊的植物。

【0012】 其中取代基被表示為視情況經取代的，這係指它們可以帶有或不帶有一個或多個相同的或不同的取代基，例如一至三個取代基。正常地，同時存在不多於三個這樣的視情況取代基。當基團被表示為被取代時，例如烷基，這包括係其他基團的一部分的那些基團，例如烷硫基中的烷基。

【0013】 術語“鹵素”係指氟、氯、溴或碘，較佳的是氟、氯或溴。

【0014】 烷基取代基(單獨或作為較大基團的一部分，例如烷氧基-、烷硫基-)可以是直鏈的或支鏈的。取決於提到的碳原子的數量，烷基其本身或作為另一取代基的部分係例如甲基、乙基、正丙基、正丁基、正戊基、正己基和它們的異構物，例如異丙基、異丁基、二級丁基、三級丁基或異戊基。

【0015】 烯基取代基(單獨或作為較大基團的一部分，例如烯基氧基)可以處於直鏈或支鏈的形式，並且該等烯基部分可以是(適當時)具有(E)-或(Z)-的組態。實例係乙烯和丙烯。該烯基基團較佳的是 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>，更較佳的是 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>並且最較佳的是 C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>烯基基團。

【0016】 炔基取代基（單獨或作為較大基團（例如炔基氧基）的一部分）可以處於直鏈或支鏈的形式。實例係乙炔基和炔丙基。該炔基基團較佳的是 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>，更較佳的是 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 並且最較佳的是 C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub> 炔基基團。

【0017】 環烷基取代基可以是飽和的或部分不飽和的，較佳的是完全飽和的，並且係例如環丙基、環丁基、環戊基或環己基。

【0018】 鹵代烷基基團（單獨或作為較大基團的一部分，例如鹵代烷基氧基）可能包含一個或多個相同或不同的鹵素原子並且，例如，可以代表 CH<sub>2</sub>Cl、CHCl<sub>2</sub>、CCl<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>F、CHF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>、CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>、CH<sub>3</sub>CF<sub>2</sub>、CF<sub>3</sub>CF<sub>2</sub> 或 CCl<sub>3</sub>CCl<sub>2</sub>。

【0019】 鹵代烯基基團（單獨或作為較大基團的一部分，例如鹵代烯基氧基）係烯基基團，其分別被一個或多個相同或不同的鹵素原子取代，並且係，例如 2,2-二氟乙炔基或 1,2-二氯-2-氟-乙炔基。

【0020】 鹵代炔基基團（單獨或作為較大基團的一部分，例如鹵代炔基氧基）係炔基基團，其分別被一個或多個相同或不同的鹵素原子取代，並且係，例如 1-氯-丙-2-炔基。

【0021】 烷氧基指的是自由基-OR，其中 R 係正如上面所定義的烷基。烷氧基基團包括，但不限於，甲氧基、乙氧基、1-甲基乙氧基、丙氧基、丁氧基、1-甲基丙氧基和 2-甲基丙氧基。

氰基指的是-CN 基團。

胺基指的是-NH<sub>2</sub> 基團。

羥基（“hydroxyl”或“hydroxy”）代表-OH 基團。

【0022】 芳基基團（單獨或作為較大基團的一部分，例如像芳基氧基、芳基-烷基）係芳香族環體系，它們可以處於單-、雙-或三環的形式。

此類環的實例包括苯基、萘基、蒽基、茚基或菲基。較佳的芳基基團係苯基與萘基，苯基係最較佳的。在芳基部分被認為被取代的情況下，該芳基部分較佳的是被一至四個取代基取代，最較佳的是被一至三個取代基取代。

**【0023】** 雜芳基基團（單獨或作為較大基團的一部分，例如像雜芳基氧基、雜芳基-烷基）係芳香族環系統，該等系統包括至少一個雜原子並且由單環或兩個或更多個稠和的環組成。較佳的是，單環將包含至多三個雜原子並且雙環系統包含至多四個雜原子，該等雜原子將較佳的是選自氮、氧以及硫。單環基團的實例包括吡啶基、嗒吡基、嘧啶基、吡嗪基、吡咯基、吡唑基、咪唑基、三唑基（例如，[1,2,4]三唑基）、呋喃基、苯硫基、噁唑基、異噁唑基、噁二唑基、噻唑基、異噻唑基以及噻二唑基。雙環基團的實例包括嘌呤基、喹啉基、吡啶基、喹啉基、吡嗪基、吡唑基、苯并咪唑基、苯并苯硫基以及苯并噻唑基。較佳的是單環的雜芳基基團，吡啶基係最較佳的。在雜芳基部分被認為被取代的情況下，該雜芳基部分較佳的是被一至四個取代基取代，最較佳的是被一至三個取代基取代。

**【0024】** 雜環基基團或雜環（單獨或作為較大基團的一部分，例如雜環基-烷基）係非芳香族環結構，其包含至多 10 個原子，該等原子包括一個或多個（較佳的是一個、兩個或三個）選自 O、S 和 N 的雜原子。單環基團的實例包括氧雜環丁烷基、4,5-二氫-異噁唑基、硫雜環丁烷基、吡咯啶基、四氫呋喃基、[1,3]二氧戊環基、哌啶基、哌嗪基、[1,4]二氧雜環己基、咪唑啶基、[1,3,5]噁二吡啶基（oxadiazinanyl）、六氫-嘧啶基、[1,3,5]三吡啶基（triazinanyl）以及咪啉基或其氧化的形式，例如 1-側氧基-硫雜環丁基以及 1,1-二側氧基-硫雜環丁基。雙環基團的實例包括 2,3-二氫-苯并呋喃基、苯并

[1,4]二氧戊環基 (dioxinyl)、苯并[1,3]二氧戊環基、吡啶基以及 2,3-二氫-苯并-[1,4]-二噁吡基。在雜環基部分被認為被取代的情況下，該雜環基部分較佳的是被一至四個取代基取代，最較佳的是被一至三個取代基取代。

**【0025】** 一種或多種可能不對稱的碳原子出現在具有化學式 (I) 之化合物中，表明該化合物能以光學異構物形式出現，即鏡像物或非鏡像物的形式。作為圍繞單鍵的受限的旋轉的結果，還可能存在阻轉異構物 (atropisomer)。化學式 (I) 之目的是包括所有那些可能的異構物形式及其混合物。本發明包括針對具有化學式 (I) 之化合物的所有那些可能的異構形式及其混合物。同樣地，化學式 (I) 旨在包括所有可能的互變異構物。本發明包括針對具有化學式 (I) 之化合物的所有可能的互變異構形式。

**【0026】** 在每種情況下，根據本發明，具有化學式 (I) 之該等化合物係自由形式、氧化形式 (如 N-氧化物) 或鹽形式 (如農藝學上可用的鹽形式)。

**【0027】** N-氧化物係三級胺的氧化形式或含氮雜芳香族化合物的氧化形式。例如，A.奧賓尼 (A. Albini) 和 S.彼拉特 (S. Pietra) 1991 年在博卡拉頓 (Boca Raton) CRC 出版社出版的名為《雜環 N-氧化物》(“Heterocyclic N-oxides”) 一書中描述了它們。

X、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>、R<sub>13</sub>、n 和 R<sub>c</sub> 的較佳的值以其任何組合係如以下列出的：

較佳的是，X 係 O。

較佳的是，R<sub>1</sub> 係氫、氟、氯、甲基或氰基。

更較佳的是，R<sub>1</sub> 係氫、氟、甲基或氰基。

最較佳的是， $R_1$  係氫或氟。

較佳的是， $R_2$  和  $R_3$  各自獨立地是氫或甲基。

更較佳的是， $R_2$  係氫並且  $R_3$  係氫或甲基；或  $R_2$  係氫或甲基並且  $R_3$  係氫。

最較佳的是， $R_2$  和  $R_3$  兩者都是氫。

**【0028】** 較佳的是  $R_4$  係氫、氟基、 $C_1$ - $C_3$  烷基、或環丙基，其中該烷基和環烷基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、氫基、甲基、甲氧基和甲基硫基。

**【0029】** 更較佳的是  $R_4$  係氫、氟基、甲基或乙基，其中該甲基和乙基可以視情況被獨立地選自氟和甲氧基的 1 至 3 個取代基取代。

**【0030】** 最較佳的是  $R_4$  係甲基或乙基（其中該甲基和乙基可以視情況被 1 至 3 個氟取代基或甲氧基取代）。

**【0031】** 較佳的是  $R_5$  和  $R_6$  各自獨立地選自氫、氟、 $C_1$ - $C_2$  烷基、 $C_1$ - $C_2$  烷氧基和  $C_1$ - $C_2$  烷基硫基；或  $R_5$  和  $R_6$  與它們所附接的碳原子一起代表  $C=O$  或環丙基，其中該環丙基可以視情況被獨立地選自氟、甲基和氫基的 1 至 2 個取代基取代。

**【0032】** 更較佳的是  $R_5$  和  $R_6$  各自獨立地選自氫、氟、甲基、甲氧基和甲基硫基；或  $R_5$  和  $R_6$  與它們所附接的碳原子一起代表環丙基。

**【0033】** 最較佳的是， $R_5$  和  $R_6$  各自獨立地選自氫和氟。

**【0034】** 較佳的是  $R_7$  係  $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_3$ - $C_4$  環烷基、 $C_2$ - $C_4$  烯基、或  $C_2$ - $C_3$  炔基，其中該烷基、環烷基、烯基、炔基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、氫基、甲基、羥基和甲基硫基。

**【0035】** 更較佳的是  $R_7$  係  $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_3$ - $C_4$  環烷基、或  $C_2$ - $C_4$  烯基，

其中該烷基、環烷基和烯基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、羥基、氰基和甲基。

【0036】 最較佳的是  $R_7$  係甲基、乙基、正丙基、異丙基、二級丁基、三級丁基、 $C_3$ - $C_4$  環烷基、或  $C_2$ - $C_4$  烯基，其中該甲基、乙基、正丙基、異丙基、二級丁基、三級丁基、環烷基和烯基可以視情況被獨立地選自氟、氯和甲基的 1 至 3 個取代基取代。

【0037】 較佳的是  $R_8$  和  $R_9$  各自獨立地選自氫、氟、 $C_1$ - $C_2$  烷基和  $C_1$ - $C_2$  烷氧基；或  $R_8$  和  $R_9$  與它們所附接的碳原子一起代表環丙基，其中該環丙基可以視情況被獨立地選自氟、氰基和甲基的 1 至 2 個取代基取代。

【0038】 更較佳的是  $R_8$  和  $R_9$  各自獨立地選自氫、氟和甲基；或  $R_8$  和  $R_9$  與它們所附接的碳原子一起代表環丙基。

【0039】 最較佳的是， $R_8$  和  $R_9$  各自獨立地選自氫或氟。

【0040】 較佳的是每個  $R_{10}$  獨立地代表鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_2$ - $C_3$  烯基、 $C_2$ - $C_3$  炔基、環丙基、甲氧基、烯丙氧基、炔丙氧基、或  $C_1$ - $C_2$  烷基硫基，其中該烷基、環丙基、烯基、炔基、甲氧基、烯丙氧基、炔丙氧基和烷基硫基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、甲基、和氰基； $n$  係 0、1、2 或 3。

【0041】 更較佳的是每個  $R_{10}$  獨立地代表氟、氯、氰基、甲基、環丙基、甲氧基或甲基硫基，其中該甲基、環丙基、甲氧基和甲基硫基可以視情況被獨立地選自氟和氯的 1 至 3 個取代基取代； $n$  係 0、1 或 2。

【0042】 最較佳的是每個  $R_{10}$  獨立地代表氟、氯、氰基或甲基，其中該甲基、環丙基、甲氧基和甲基硫基可以視情況被 1 至 3 個氟取代基取代；

n 係 0、1 或 2。

【0043】 較佳的是每個  $R_c$  獨立地選自氫、甲基、乙基、烯丙基、炔丙基、和環丙基甲基，其中該甲基、乙基、烯丙基、炔丙基、和環丙基甲基基團可以視情況被獨立地選自氟和氯的 1 至 3 個取代基取代。

【0044】 最較佳的是每個  $R_c$  獨立地選自甲基、乙基、烯丙基、炔丙基、和環丙基甲基，其中該甲基、乙基、烯丙基、炔丙基、和環丙基甲基基團可以視情況被獨立地選自氟和氯的 1 至 3 個取代基取代。

較佳的是， $R_{11}$  係氫、氟、氯、甲基或氰基。

更較佳的是， $R_{11}$  係氫、氟、甲基或氯。

最較佳的是， $R_{11}$  係氫或氟。

較佳的是， $R_{12}$  和  $R_{13}$  各自獨立地選自氫、氟、甲基和羥基。

更較佳的是， $R_{12}$  和  $R_{13}$  各自獨立地選自氫、氟、和甲基。

最較佳的是， $R_{12}$  和  $R_{13}$  兩者都是氫。

【0045】 如以下列出的提供了根據本發明所述的實施方式。

實施方式 1 提供了如以上所定義的具有化學式 (I) 之化合物，或其鹽或 N-氧化物。

實施方式 2 提供了根據實施方式 1 所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中  $R_1$  係氫、氟、氯、甲基、或氰基。

實施方式 3 提供了根據實施方式 1 或 2 所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中  $R_2$  和  $R_3$  各自獨立地是氫或甲基。

實施方式 4 提供了根據實施方式 1、2 或 3 中任一項所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中  $R_4$  係氫、氰基、 $C_1$ - $C_3$  烷基、或環丙基，其中該烷基

和環烷基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、氰基、甲基、甲氧基和甲基硫基。

實施方式 5 提供了根據實施方式 1、2、3 或 4 中任一項所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中  $R_5$  和  $R_6$  各自獨立地選自氫、氟、 $C_1$ - $C_2$  烷基、 $C_1$ - $C_2$  烷氧基和  $C_1$ - $C_2$  烷基硫基；或  $R_5$  和  $R_6$  與它們所附接的碳原子一起代表 C=O 或環丙基，其中該環丙基可以視情況被獨立地選自氟、甲基和氰基的 1 至 2 個取代基取代。

實施方式 6 提供了根據實施方式 1、2、3、4 或 5 中任一項所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中  $R_7$  係  $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_3$ - $C_4$  環烷基、 $C_2$ - $C_4$  烯基、或  $C_2$ - $C_3$  炔基，其中該烷基、環烷基、烯基、炔基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、氰基、甲基、羥基和甲基硫基。

實施方式 7 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5 或 6 中任一項所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中  $R_8$  和  $R_9$  各自獨立地選自氫、氟、 $C_1$ - $C_2$  烷基和  $C_1$ - $C_2$  烷氧基；或  $R_8$  和  $R_9$  與它們所附接的碳原子一起代表環丙基，其中該環丙基可以視情況被獨立地選自氟、氰基和甲基的 1 至 2 個取代基取代。

實施方式 8 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6 或 7 中任一項所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中每個  $R_{10}$  獨立地代表鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_2$ - $C_3$  烯基、 $C_2$ - $C_3$  炔基、環丙基、甲氧基、烯丙氧基、炔丙氧基、或  $C_1$ - $C_2$  烷基硫基，其中該烷基、環丙基、烯基、炔基、甲氧基、烯丙氧基、炔丙氧基和烷基硫基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、甲基、和氰基； $n$  係 0、1、2 或 3。

實施方式 9 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7 或 8 中任一項所

述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中每個 R<sub>c</sub> 獨立地選自氫、甲基、乙基、烯丙基、炔丙基、和環丙基甲基，其中該甲基、乙基、烯丙基、炔丙基、和環丙基甲基基團可以視情況被獨立地選自氟和氯的 1 至 3 個取代基取代。

實施方式 10 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8 或 9 中任一項所述的化合物，或其鹽或 N-氧化物，其中 R<sub>1</sub> 係氫、氟、甲基、或氰基。

實施方式 11 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9 或 10 中任一項所述的化合物，或其鹽或 N-氧化物，其中 R<sub>2</sub> 係氫並且 R<sub>3</sub> 係氫或甲基；或 R<sub>2</sub> 係氫或甲基並且 R<sub>3</sub> 係氫。

實施方式 12 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10 或 11 中任一項所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中 R<sub>4</sub> 係氫、氰基、甲基或乙基，其中該甲基和乙基可以視情況被獨立地選自氟和甲氧基的 1 至 3 個取代基取代。

實施方式 13 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11 或 12 中任一項所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中 R<sub>5</sub> 和 R<sub>6</sub> 各自獨立地選自氫、氟、甲基、甲氧基和甲基硫基；或 R<sub>5</sub> 和 R<sub>6</sub> 與它們所附接的碳原子一起代表環丙基。

實施方式 14 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12 或 13 中任一項所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中 R<sub>7</sub> 係 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> 環烷基、或 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烯基，其中該烷基、環烷基和烯基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、羥基、氰基和甲基。

實施方式 15 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13 或 14 中任一項所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中 R<sub>8</sub> 和 R<sub>9</sub> 各

自獨立地選自氫、氟和甲基；或  $R_8$  和  $R_9$  與它們所附接的碳原子一起代表環丙基。

實施方式 16 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14 或 15 中任一項所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中每個  $R_{10}$  獨立地代表氟、氯、氰基、甲基、環丙基、甲氧基或甲基硫基，其中該甲基、環丙基、甲氧基和甲基硫基可以視情況被獨立地選自氟和氯的 1 至 3 個取代基取代；n 係 0、1 或 2。

實施方式 17 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15 或 16 中任一項所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中每個  $R_c$  獨立地選自甲基、乙基、烯丙基、炔丙基、和環丙基甲基，其中該甲基、乙基、烯丙基、炔丙基、和環丙基甲基基團可以視情況被獨立地選自氟和氯的 1 至 3 個取代基取代。

實施方式 18 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16 或 17 中任一項所述的化合物，或其鹽或 N-氧化物，其中  $R_1$  係氫或氟。

實施方式 19 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17 或 18 中任一項所述的化合物，或其鹽或 N-氧化物，其中  $R_2$  和  $R_3$  兩者都是氫。

實施方式 20 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18 或 19 中任一項所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中  $R_4$  係甲基或乙基（其中該甲基和乙基可以視情況被 1 至 3 個氟取代基取代）。

實施方式 21 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19 或 20 中任一項所述的化合物，或其鹽或 N-氧化物，其中 R<sub>5</sub>和 R<sub>6</sub>各自獨立地選自氫和氟。

實施方式 22 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20 或 21 中任一項所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中 R<sub>7</sub>係甲基、乙基、正丙基、異丙基、二級丁基、三級丁基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>環烷基、或 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基，其中該甲基、乙基、正丙基、異丙基、二級丁基、三級丁基、環烷基和烯基可以視情況被獨立地選自氟、氯和甲基的 1 至 3 個取代基取代。

實施方式 23 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21 或 22 中任一項所述的化合物，或其鹽或 N-氧化物，其中 R<sub>8</sub>和 R<sub>9</sub>各自獨立地選自氫或氟。

實施方式 24 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22 或 23 中任一項所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中每個 R<sub>10</sub>獨立地代表氟、氯、氰基或甲基，其中該甲基、環丙基、甲氧基和甲基硫基可以視情況被 1 至 3 個氟取代基取代；n 係 0、1 或 2。

實施方式 25 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23 或 24 中任一項所述之化合物、或其鹽或 N-氧化物，其中 R<sub>11</sub>係氫、氟、氯、甲基或氰基。實施方式 26 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24 或 25 中任一項所述之化合

物、或其鹽或 N-氧化物，其中  $R_{12}$  和  $R_{13}$  各自獨立地選自氫、氟、甲基和羥基。

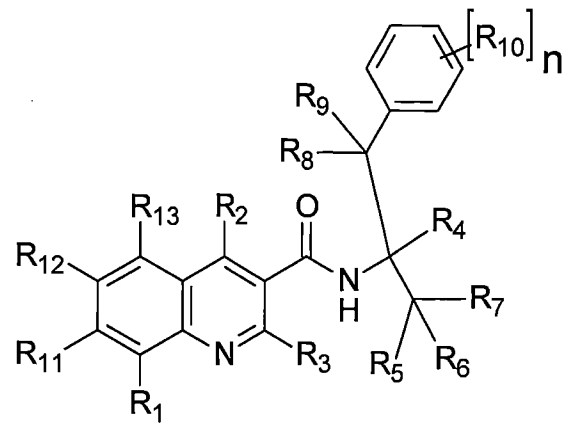
實施方式 27 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25 或 26 中任一項所述的化合物，或其鹽或 N-氧化物，其中  $R_{11}$  係氫、氟、甲基或氯。

實施方式 28 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26 或 27 中任一項所述的化合物，或其鹽或 N-氧化物，其中  $R_{12}$  和  $R_{13}$  各自獨立地選自氫、氟和甲基。

實施方式 29 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27 或 28 中任一項所述的化合物，或其鹽或 N-氧化物，其中  $R_{11}$  係氫或氟。

實施方式 30 提供了根據實施方式 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、15、16、17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28 或 29 中任一項所述的化合物，或其鹽或 N-氧化物，其中  $R_{12}$  和  $R_{13}$  兩者都是氫。

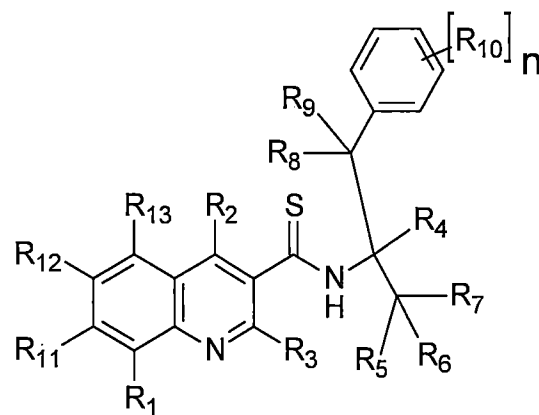
**【0046】** 根據本發明所述的一組化合物係具有化學式 (I') 的那些：



(I')

其中 R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>、R<sub>13</sub>、n 和 R<sub>c</sub> 係如對於具有化學式 (I) 之化合物所定義的，或其鹽或 N-氧化物。R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>、R<sub>13</sub>、n 和 R<sub>c</sub> 的較佳的定義係如對於具有化學式 (I) 之化合物所定義的。

【0047】 根據本發明所述的一組化合物係具有化學式 (I'') 的那些：



(I'')

其中 R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>、R<sub>13</sub>、n 和 R<sub>c</sub> 係如對於具有化學式 (I) 之化合物所定義的，或其鹽或 N-氧化物。R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>、R<sub>13</sub>、n 和 R<sub>c</sub> 的較佳的定義係如對於具有化學式 (I) 之化合物所定義的。

【0048】 根據本發明所述的一組較佳的化合物係具有化學式 (I-1) 的那些，它們係具有化學式 (I) 之化合物，其中 X 係 O 或 S；R<sub>1</sub> 係氫、氟、

氫、甲基或氰基；R<sub>2</sub>和 R<sub>3</sub>各自獨立地是氫或甲基；R<sub>4</sub>係氫、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、或環丙基，其中該烷基和環烷基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、氰基、甲基、甲氧基和甲基硫基；R<sub>5</sub>和 R<sub>6</sub>各自獨立地選自氫、氟、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基硫基；或 R<sub>5</sub>和 R<sub>6</sub>與它們所附接的碳原子一起代表 C=O 或環丙基，其中該環丙基可以視情況被獨立地選自氟、甲基和氰基的 1 至 2 個取代基取代；R<sub>7</sub>係 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>烯基、或 C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>炔基，其中該烷基、環烷基、烯基、炔基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、氰基、甲基、羥基和甲基硫基；R<sub>8</sub>和 R<sub>9</sub>各自獨立地選自氫、氟、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基和 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷氧基；或 R<sub>8</sub>和 R<sub>9</sub>與它們所附接的碳原子一起代表環丙基，其中該環丙基可以視情況被獨立地選自氟、氰基和甲基的 1 至 2 個取代基取代；每個 R<sub>10</sub>獨立地代表鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>炔基、環丙基、甲氧基、烯丙氧基、炔丙氧基、或 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>烷基硫基，其中該烷基、環丙基、烯基、炔基、甲氧基、烯丙氧基、炔丙氧基和烷基硫基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、甲基、和氰基；n 係 0、1、2 或 3；R<sub>11</sub>係氫、氟、氯、甲基或氰基；並且 R<sub>12</sub>和 R<sub>13</sub>各自獨立地選自氫、氟、甲基和羥基；或其鹽或 N-氧化物。

**【0049】** 根據此實施方式所述的一組化合物係具有化學式 (I-1a) 之化合物，它們係具有化學式 (I-1) 之化合物，其中 X 係 O。

**【0050】** 根據此實施方式所述的另一組化合物係具有化學式 (I-1b) 之化合物，它們係具有化學式 (I-1) 之化合物，其中 X 係 S。

**【0051】** 根據本發明所述的另一組較佳的化合物係具有化學式 (I-2)

的那些，它們係具有化學式 (I) 之化合物，其中 X 係 O 或 S；R<sub>1</sub> 係氫、氟、甲基或氰基；R<sub>2</sub> 係氫並且 R<sub>3</sub> 係氫或甲基；或 R<sub>2</sub> 係氫或甲基並且 R<sub>3</sub> 係氫；R<sub>4</sub> 係氫、氟基、甲基或乙基，其中該甲基和乙基可以視情況被獨立地選自氟和甲氧基的 1 至 3 個取代基取代；R<sub>5</sub> 和 R<sub>6</sub> 各自獨立地選自氫、氟、甲基、甲氧基和甲基硫基；或 R<sub>5</sub> 和 R<sub>6</sub> 連同它們所附接的碳原子一起表示環丙基；R<sub>7</sub> 係 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> 環烷基、或 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烯基、其中該烷基、環烷基和烯基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、羥基、氰基和甲基；R<sub>8</sub> 和 R<sub>9</sub> 各自獨立地選自氫、氟和甲基；或 R<sub>8</sub> 和 R<sub>9</sub> 連同它們所附接的碳原子一起表示環丙基；每個 R<sub>10</sub> 獨立地代表氟、氯、氰基、甲基、環丙基、甲氧基或甲基硫基，其中該甲基、環丙基、甲氧基和甲基硫基可以視情況被獨立地選自氟和氯的 1 至 3 個取代基取代；n 係 0、1 或 2；R<sub>11</sub> 係氫、氟、甲基或氯；並且 R<sub>12</sub> 和 R<sub>13</sub> 各自獨立地選自氫、氟和甲基；或其鹽或 N-氧化物。

**【0052】** 根據此實施方式所述的一組化合物係具有化學式 (I-2a) 之化合物，它們係具有化學式 (I-2) 之化合物，其中 X 係 O。

**【0053】** 根據此實施方式所述的另一組化合物係具有化學式 (I-2b) 之化合物，它們係具有化學式 (I-2) 之化合物，其中 X 係 S。

**【0054】** 根據本發明所述的另一組較佳的化合物係具有化學式 (I-3) 的那些，它們係具有化學式 (I) 之化合物，其中 X 係 O 或 S；R<sub>1</sub> 係氫或氟；R<sub>2</sub> 和 R<sub>3</sub> 都是氫；R<sub>4</sub> 係甲基或乙基（其中該甲基和乙基可以視情況被 1 至 3 個氟取代基取代）；R<sub>5</sub> 和 R<sub>6</sub> 各自獨立地選自氫和氟；R<sub>7</sub> 係甲基、乙基、正丙基、異丙基、二級丁基、三級丁基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> 環烷基、或 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烯基，其中該甲

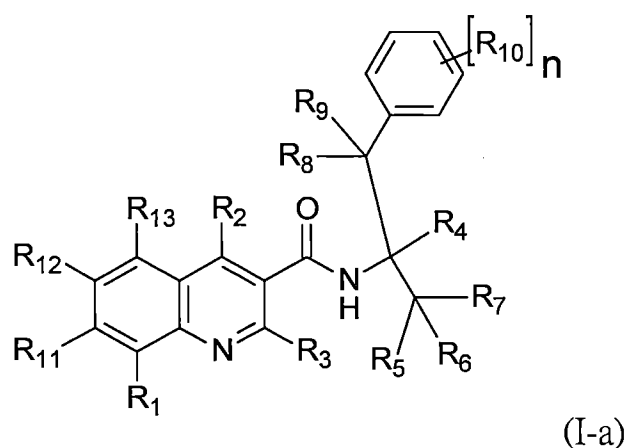
基、乙基、正丙基、異丙基、二級丁基、三級丁基、環烷基和烯基可以視情況被獨立地選自氟、氯和甲基的 1 至 3 個取代基取代； $R_8$  和  $R_9$  各自獨立地選自氫或氟；每個  $R_{10}$  獨立地代表氟、氯、氰基或甲基，其中該甲基、環丙基、甲氧基和甲基硫基可以視情況被 1 至 3 個氟取代基取代； $n$  係 0、1 或 2；並且  $R_{11}$  係氫或氟； $R_{12}$  和  $R_{13}$  都是氫；或其鹽或 N-氧化物。

【0055】 根據此實施方式所述的一組化合物係具有化學式 (I-3a) 之化合物，它們係具有化學式 (I-3) 之化合物，其中 X 係 O。

【0056】 根據此實施方式所述的另一組化合物係具有化學式 (I-3b) 之化合物，它們係具有化學式 (I-3) 之化合物，其中 X 係 S。

【0057】 根據本發明所述的化合物可以具有任何數量的益處，尤其包括針對保護植物對抗由真菌引起的疾病的有利水平的生物活性或對於用作農用化學品活性成分的優越特性（例如，更高的生物活性、有利的活性譜、增加的安全性、改進的物理-化學特性、或增加的生物可降解性）。

【0058】 在下表 A1 至 A13 中示意了具有化學式 (I) 之化合物的具體實例：表 A1 提供了 248 種具有化學式 (I-a) 之化合物



其中  $R_1$ 、 $R_2$  和  $R_3$  都是 H 並且  $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 、 $R_{13}$  都是 H

並且其中  $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$  和  $R_{10}$  以及  $n$  (如果出現  $R_{10}$  和  $n$ ) 的值係如在下表 Z 中所定義的：

表 Z

條目	$R_4$	$R_5$	$R_6$	$R_7$	$R_8$	$R_9$	$R_{10}$
1	H	H	H	CH <sub>3</sub>	H	H	-
2	H	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
3	H	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
4	H	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	-
5	H	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
6	H	H	H	CH=CH <sub>2</sub>	H	H	-
7	H	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	-
8	H	H	H	C(Cl)=CH <sub>2</sub>	H	H	-
9	H	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CF <sub>2</sub>	H	H	-
10	H	H	H	C(F)=CH <sub>2</sub>	H	H	-
11	H	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	-
12	H	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
13	H	H	H	C(OH)(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
14	H	H	H	C(CN)(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
15	H	H	H	C(SCH <sub>3</sub> )(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
16	H	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	-
17	H	H	H	CHF <sub>2</sub>	H	H	-
18	H	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
19	H	H	H	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	-
20	H	H	H	CH=CF <sub>2</sub>	H	H	-
21	H	H	H	CH=C(CH <sub>3</sub> )H	H	H	-
22	H	H	H	CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-

條目	R <sub>4</sub>	R <sub>5</sub>	R <sub>6</sub>	R <sub>7</sub>	R <sub>8</sub>	R <sub>9</sub>	R <sub>10</sub>
23	H	H	H	環丙基	H	H	-
24	H	H	H	1-甲基環丙基	H	H	-
25	H	H	H	1-氟環丙基	H	H	-
26	H	H	H	1-氰基環丙基	H	H	-
27	H	H	H	1-甲基硫代環丙基	H	H	-
28	H	H	H	環丁基	H	H	-
29	H	H	H	1-氟環丁基	H	H	-
30	H	H	H	3,3-二氟環丁基	H	H	-
31	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	H	-
32	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
33	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
34	CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	-
35	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
36	CH <sub>3</sub>	H	H	CH=CH <sub>2</sub>	H	H	-
37	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	-
38	CH <sub>3</sub>	H	H	C(Cl)=CH <sub>2</sub>	H	H	-
39	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CF <sub>2</sub>	H	H	-
40	CH <sub>3</sub>	H	H	C(F)=CH <sub>2</sub>	H	H	-
41	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	-
42	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
43	CH <sub>3</sub>	H	H	C(OH)(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
44	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CN)(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
45	CH <sub>3</sub>	H	H	C(SCH <sub>3</sub> )(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
46	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	-
47	CH <sub>3</sub>	H	H	CHF <sub>2</sub>	H	H	-

條目	R <sub>4</sub>	R <sub>5</sub>	R <sub>6</sub>	R <sub>7</sub>	R <sub>8</sub>	R <sub>9</sub>	R <sub>10</sub>
48	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
49	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	-
50	CH <sub>3</sub>	H	H	CH=CF <sub>2</sub>	H	H	-
51	CH <sub>3</sub>	H	H	CH=C(CH <sub>3</sub> )H	H	H	-
52	CH <sub>3</sub>	H	H	CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
53	CH <sub>3</sub>	H	H	環丙基	H	H	-
54	CH <sub>3</sub>	H	H	1-甲基環丙基	H	H	-
55	CH <sub>3</sub>	H	H	1-氟環丙基	H	H	-
56	CH <sub>3</sub>	H	H	1-氯基環丙基	H	H	-
57	CH <sub>3</sub>	H	H	1-甲基硫代環丙基	H	H	-
58	CH <sub>3</sub>	H	H	環丁基	H	H	-
59	CH <sub>3</sub>	H	H	1-氟環丁基	H	H	-
60	CH <sub>3</sub>	H	H	3,3-二氟環丁基	H	H	-
61	H	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	H	H	-
62	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	-
63	H	環丙基		CH <sub>3</sub>	H	H	
64	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
65	H	環丙基		CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	
66	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	-
67	CH <sub>3</sub>	H	H	F	H	H	-
68	CH <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	-
69	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	H	-
70	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	F	H	H	-
71	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	Cl	H	H	-
72	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	H	-

條目	R <sub>4</sub>	R <sub>5</sub>	R <sub>6</sub>	R <sub>7</sub>	R <sub>8</sub>	R <sub>9</sub>	R <sub>10</sub>
73	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
74	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
75	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
76	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CH=CH <sub>2</sub>	H	H	-
77	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	-
78	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	-
79	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
80	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	C(CN)(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
81	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	C(SCH <sub>3</sub> )(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
82	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	-
83	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CHF <sub>2</sub>	H	H	-
84	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
85	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	環丙基	H	H	-
86	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	1-甲基環丙基	H	H	-
87	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	1-氟環丙基	H	H	-
88	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	1-氰基環丙基	H	H	-
89	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	1-甲基硫代環丙基	H	H	-
90	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	環丁基	H	H	-
91	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	1-氟環丁基	H	H	-
92	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	3,3-二氟環丁基	H	H	-
93	CN	H	H	CH <sub>3</sub>	H	H	-
94	CN	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
95	CN	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
96	CN	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
97	CN	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	-

條目	R <sub>4</sub>	R <sub>5</sub>	R <sub>6</sub>	R <sub>7</sub>	R <sub>8</sub>	R <sub>9</sub>	R <sub>10</sub>
98	CN	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
99	CN	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	-
100	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>3</sub>	H	H	-
101	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	H	-
102	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
103	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	CH=CH <sub>2</sub>	H	H	-
104	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	-
105	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	-
106	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
107	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	-
108	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	CHF <sub>2</sub>	H	H	-
109	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
110	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> Cl	H	H	-
111	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	CH=CF <sub>2</sub>	H	H	-
112	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	環丙基	H	H	-
113	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	1-甲基環丙基	H	H	-
114	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	1-氟環丙基	H	H	-
115	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	1-氟基環丙基	H	H	-
116	CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	H	-
117	CH <sub>3</sub>	F	F	F	H	H	-
118	CH <sub>3</sub>	F	F	CH <sub>3</sub>	H	H	-
119	CH <sub>3</sub>	F	F	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
120	CH <sub>3</sub>	F	F	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
121	CH <sub>3</sub>	F	F	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
122	CH <sub>3</sub>	F	F	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	-
123	CH <sub>3</sub>	F	F	環丙基	H	H	-

條目	R <sub>4</sub>	R <sub>5</sub>	R <sub>6</sub>	R <sub>7</sub>	R <sub>8</sub>	R <sub>9</sub>	R <sub>10</sub>
124	CH <sub>3</sub>	F	F	1-甲基環丙基	H	H	-
125	CH <sub>3</sub>	F	F	環丁基	H	H	-
126	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	-
127	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	H	H	-
128	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	-
129	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
130	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
131	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	H	H	-
132	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	-
133	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	環丙基	H	H	-
134	CH <sub>3</sub>	環丙基		H	H	H	-
135	CH <sub>3</sub>	環丙基		F	H	H	-
136	CH <sub>3</sub>	環丙基		Cl	H	H	-
137	CH <sub>3</sub>	環丙基		CH <sub>3</sub>	H	H	-
138	CH <sub>3</sub>	環丙基		CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
139	CH <sub>3</sub>	環丙基		CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
140	CH <sub>3</sub>	環丙基		CH=CH <sub>2</sub>	H	H	-
141	CH <sub>3</sub>	環丙基		C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	-
142	CH <sub>3</sub>	環丙基		環丙基	H	H	-
143	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	H	H	H	-
144	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	F	H	H	-
145	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	CH <sub>3</sub>	H	H	-
146	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
147	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
148	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
149	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	H	H	-

條目	R <sub>4</sub>	R <sub>5</sub>	R <sub>6</sub>	R <sub>7</sub>	R <sub>8</sub>	R <sub>9</sub>	R <sub>10</sub>
150	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	環丙基	H	H	-
151	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	1-甲基環丙基	H	H	-
152	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	F	F	環丁基	H	H	-
153	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H	-
154	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	F	H	H	-
155	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	H	H	-
156	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	-
157	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
158	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
159	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	H	H	-
160	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	-
161	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	環丙基	H	H	-
162	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	環丙基		H	H	H	-
163	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	環丙基		F	H	H	-
164	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	環丙基		Cl	H	H	-
165	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	環丙基		CH <sub>3</sub>	H	H	-
166	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	環丙基		CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	-
167	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	環丙基		CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	-
168	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	環丙基		CH=CH <sub>2</sub>	H	H	-
169	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	環丙基		C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	-
170	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	環丙基		環丙基	H	H	-
171	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	2-F
172	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	3-F
173	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	4-F
174	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	2-Cl
175	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	3-Cl

條目	R <sub>4</sub>	R <sub>5</sub>	R <sub>6</sub>	R <sub>7</sub>	R <sub>8</sub>	R <sub>9</sub>	R <sub>10</sub>
176	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	4-Cl
177	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	2-CH <sub>3</sub>
178	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	3-CH <sub>3</sub>
179	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	4-CH <sub>3</sub>
180	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	2-CN
181	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	3-CN
182	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	4-CN
183	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	2-SCH <sub>3</sub>
184	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	3-SCH <sub>3</sub>
185	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	4-SCH <sub>3</sub>
186	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	F	F	-
187	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-
188	CH <sub>3</sub>	H	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	環丙基		-
189	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	2-F
190	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	3-F
191	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	4-F
192	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	2-Cl
193	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	3-Cl
194	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	4-Cl
195	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	2-CH <sub>3</sub>
196	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	3-CH <sub>3</sub>
197	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	4-CH <sub>3</sub>
198	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	2-CN
199	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	3-CN
200	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	4-CN
201	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	2-SCH <sub>3</sub>

條目	R <sub>4</sub>	R <sub>5</sub>	R <sub>6</sub>	R <sub>7</sub>	R <sub>8</sub>	R <sub>9</sub>	R <sub>10</sub>
202	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	3-SCH <sub>3</sub>
203	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	H	H	4-SCH <sub>3</sub>
204	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	2-F
205	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	3-F
206	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	4-F
207	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	2-Cl
208	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	3-Cl
209	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	4-Cl
210	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	2-CH <sub>3</sub>
211	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	3-CH <sub>3</sub>
212	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	4-CH <sub>3</sub>
213	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	2-CN
214	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	3-CN
215	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	4-CN
216	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	2-SCH <sub>3</sub>
217	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	3-SCH <sub>3</sub>
218	CH <sub>3</sub>	H	H	C(CH <sub>3</sub> )=CH <sub>2</sub>	H	H	4-SCH <sub>3</sub>
219	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	2-F
220	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	3-F
221	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	4-F
222	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	2-Cl
223	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	3-Cl
224	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	4-Cl
225	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	2-CH <sub>3</sub>
226	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	3-CH <sub>3</sub>
227	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	4-CH <sub>3</sub>

條目	R <sub>4</sub>	R <sub>5</sub>	R <sub>6</sub>	R <sub>7</sub>	R <sub>8</sub>	R <sub>9</sub>	R <sub>10</sub>
228	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	2-CN
229	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	3-CN
230	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	4-CN
231	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	2-SCH <sub>3</sub>
232	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	3-SCH <sub>3</sub>
233	CH <sub>3</sub>	H	H	CF(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	H	4-SCH <sub>3</sub>
234	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	2-F
235	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	3-F
236	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	4-F
237	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	2-Cl
238	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	3-Cl
239	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	4-Cl
240	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	2-CH <sub>3</sub>
241	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	3-CH <sub>3</sub>
242	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	4-CH <sub>3</sub>
243	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	2-CN
244	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	3-CN
245	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	4-CN
246	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	2-SCH <sub>3</sub>
247	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	3-SCH <sub>3</sub>
248	CH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	H	4-SCH <sub>3</sub>

表 A2 提供了 248 種具有化學式 (I-a) 之化合物，其中 R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>、R<sub>13</sub> 都是 H，R<sub>1</sub> 係氟，R<sub>2</sub> 和 R<sub>3</sub> 係 H 並且其中 R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub> 和 R<sub>10</sub> 的值係如在上表 Z 中所定義的。

表 A3 提供了 248 種具有化學式 (I-a) 之化合物，其中 R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>、R<sub>13</sub> 都是

H, R<sub>1</sub> 係氯, R<sub>2</sub> 和 R<sub>3</sub> 係 H 並且其中 R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub> 和 R<sub>10</sub> 的值係如在上表 Z 中所定義的。

表 A4 提供了 248 種具有化學式 (I-a) 之化合物, 其中 R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>、R<sub>13</sub> 都是 H, R<sub>1</sub> 係溴, R<sub>2</sub> 和 R<sub>3</sub> 係 H 並且其中 R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub> 和 R<sub>10</sub> 的值係如在上表 Z 中所定義的。

表 A5 提供了 248 種具有化學式 (I-a) 之化合物, 其中 R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>、R<sub>13</sub> 都是 H, R<sub>1</sub> 係甲基, R<sub>2</sub> 和 R<sub>3</sub> 係 H 並且其中 R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub> 和 R<sub>10</sub> 的值係如在上表 Z 中所定義的。

表 A6 提供了 248 種具有化學式 (I-a) 之化合物, 其中 R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>、R<sub>13</sub> 都是 H, R<sub>1</sub> 係氰基, R<sub>2</sub> 和 R<sub>3</sub> 係 H 並且其中 R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub> 和 R<sub>10</sub> 的值係如在上表 Z 中所定義的。

表 A7 提供了 248 種具有化學式 (I-a) 之化合物, 其中 R<sub>11</sub> 係氟, R<sub>1</sub> 係 H, R<sub>2</sub> 和 R<sub>3</sub> 係 H 並且其中 R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub> 和 R<sub>10</sub> 的值係如在上表 Z 中所定義的。

表 A8 提供了 248 種具有化學式 (I-a) 之化合物, 其中 R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>、R<sub>13</sub> 都是 H, R<sub>2</sub> 係甲基, R<sub>1</sub> 和 R<sub>3</sub> 係 H 並且其中 R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub> 和 R<sub>10</sub> 的值係如在上表 Z 中所定義的。

表 A9 提供了 248 種具有化學式 (I-a) 之化合物, 其中 R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>、R<sub>13</sub> 都是 H, R<sub>3</sub> 係甲基, R<sub>1</sub> 和 R<sub>2</sub> 係 H 並且其中 R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub> 和 R<sub>10</sub> 的值係如在上表 Z 中所定義的。

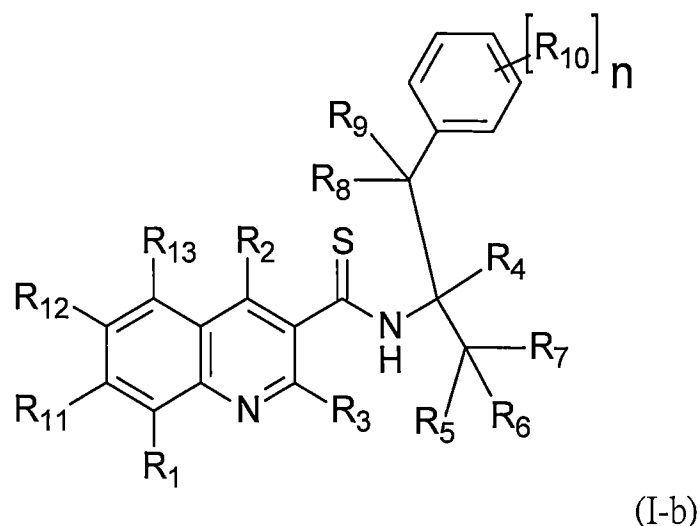
表 A10 提供了 248 種具有化學式 (I-a) 之化合物, 其中 R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>、R<sub>13</sub> 都是 H, R<sub>2</sub> 係甲基, R<sub>1</sub> 係氟且 R<sub>3</sub> 係 H 並且其中 R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub> 和 R<sub>10</sub>

的值係如在上表 Z 中所定義的。

表 A11 提供了 248 種具有化學式 (I-a) 之化合物，其中  $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 、 $R_{13}$  都是 H， $R_3$  係甲基， $R_1$  係氟且  $R_2$  係 H 並且其中  $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$  和  $R_{10}$  的值係如在上表 Z 中所定義的。

表 A12 提供了 248 種具有化學式 (I-a) 之化合物，其中  $R_{12}$ 、 $R_{13}$  係 H， $R_2$  和  $R_3$  係 H， $R_1$  和  $R_{11}$  係氟，並且其中  $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$  和  $R_{10}$  的值係如在上表 Z 中所定義的。

表 A13 提供了 248 種具有化學式 (I-b) 之化合物



其中  $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 、 $R_{13}$ 、 $R_1$ 、 $R_2$  和  $R_3$  都是 H

並且其中  $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$  和  $R_{10}$  的值係如在上表 Z 中所定義的。

表 A14 提供了 248 種具有化學式 (I-b) 之化合物，其中  $R_1$  係氟， $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 、 $R_{13}$ 、 $R_2$  和  $R_3$  係 H 並且其中  $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$  和  $R_{10}$  的值係如在上表 Z 中所定義的。

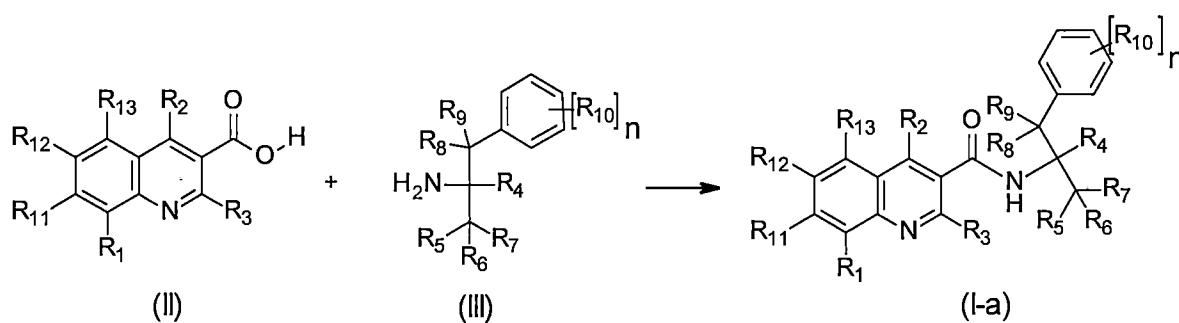
#### 【圖式簡單說明】

無

## 【實施方式】

【0059】 本發明所述的化合物可以如在以下流程中所示來製備，其中（除非另外說明）每一變數的定義係如以上針對具有化學式 (I) 之化合物所定義的。

【0060】 如在流程 1 中所示，具有通式 (I-a) 之化合物（其中  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 、 $R_{13}$  和  $n$  係如對於具有化學式 (I) 之化合物所定義的並且  $X$  係  $O$ ）可以藉由具有化學式 (II) 之化合物（其中  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 、和  $R_{13}$  係如對於具有化學式 (I) 之化合物所定義的）與具有化學式 (III) 之胺（其中  $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$  和  $n$  係如對於具有化學式 (I) 之化合物所定義的）的反應進行製備。

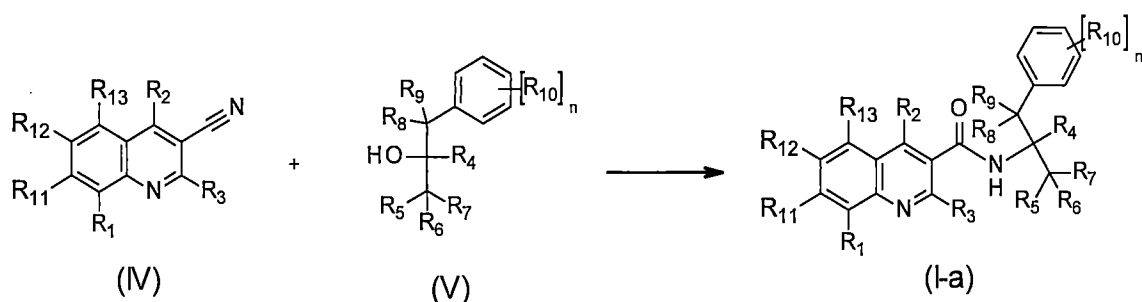


流程 1

【0061】 在用於該轉化的各種報導的方法中，最廣泛應用的方法涉及在諸如四氫呋喃（THF）或二甲基甲醯胺（DMF）的惰性有機溶劑中用活化劑如亞硫醯氯或醯胺偶合劑如二環己基碳二亞胺處理羧酸 (II) 和在催化劑如二甲基胺基吡啶的存在下與胺 (III) 反應，如英國化學會評論 (*Chem. Soc. Rev.*)，2009，606-631 或四面體 (*Tetrahedron*) 2005，10827-10852) 中所描述的。

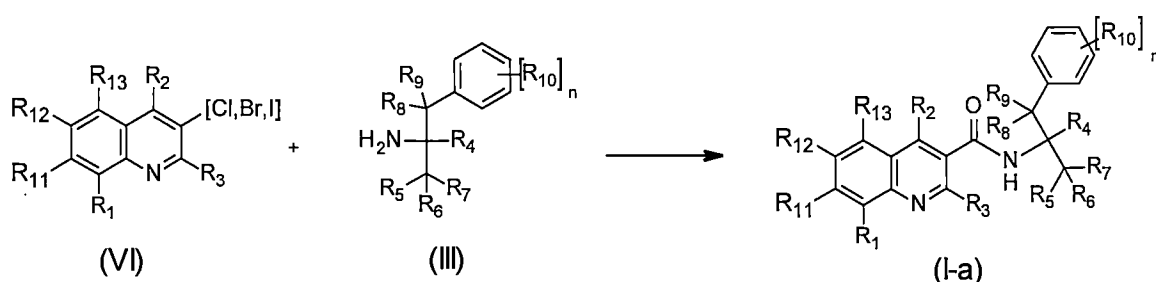
【0062】 如流程 2 中所示，其中  $X$  為  $O$  的具有通式 (I-a) 之化合物也

可以藉由，在溶劑如二氯甲烷或乙酸中、在 $-20^{\circ}\text{C}$  至 $+50^{\circ}\text{C}$  之間的溫度下，使具有化學式 (IV) 和 (V) 之化合物在布朗斯台德酸 (Brönsted acid) 如硫酸或三氟甲磺酸的存在下反應來製備，如《歐洲無機化學雜誌》(Eur. J. Org. Chem.) 2015, 2727-2732 和合成 (Synthesis) 2000, 1709-1712 中所描述的。



流程 2

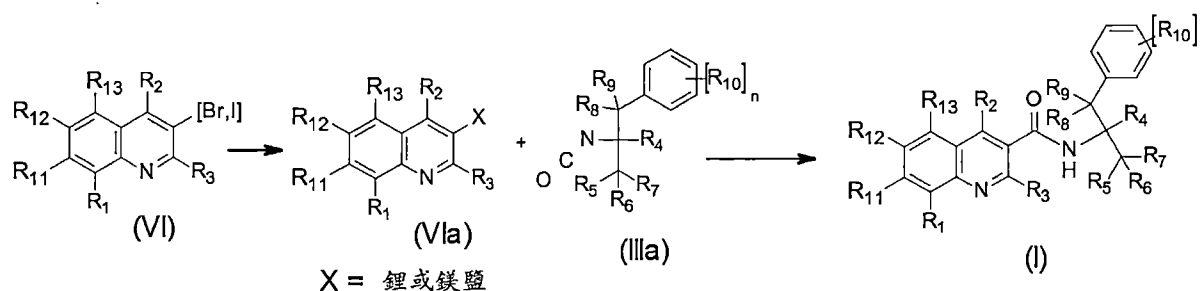
【0063】 可替代地，其中 X 為 O 的具有通式 (I-a) 之化合物也可以藉由，在惰性有機溶劑如 1,4-二噁咁中、在 $20^{\circ}\text{C}$  至 $110^{\circ}\text{C}$  的溫度下，使具有化學式 (VI) 之化合物與具有化學式 (III) 之胺、一氧化碳、鹼如三乙胺或碳酸鉀和適當負載的過渡金屬催化劑如鈀反應來製備，如在《有機通訊》(Org. Lett.) 2014, 4296-4299 (及其中的參考文獻) 中所描述的並示於流程 3 中。



流程 3

【0064】 可替代地，其中 X 為 O 的具有通式 (I-a) 之化合物也可以藉由，在惰性有機溶劑如乙醚或 THF 中、在 $-78^{\circ}\text{C}$  至 $+40^{\circ}\text{C}$  之間的溫度下，使具有化學式 (VIa) 之有機金屬化合物與具有化學式 (IIIa) 之異氰酸酯反應來製備，如在應用化學國際版本 (Angew. Chem. Int. Ed.) 2012, 9173-9175

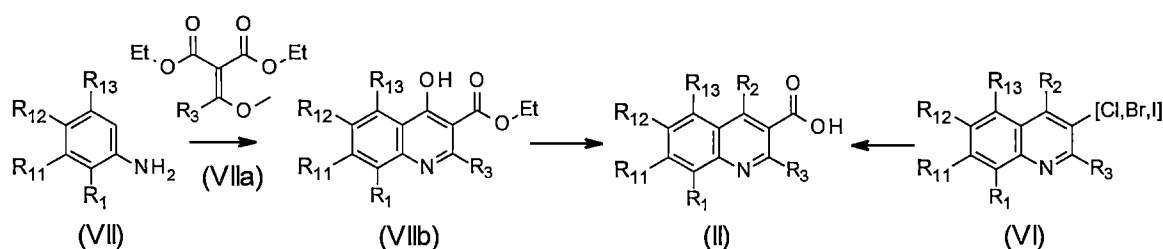
中所描述的並示於流程 4 中。



流程 4

【0065】 在醚溶劑如 THF 中、在 $-90^{\circ}\text{C}$  和 $+20^{\circ}\text{C}$  之間的溫度下，藉由從具有化學式 (VI) 化合物與烷基鋰試劑如三級丁基鋰的鋰-鹵素交換或與三正丁基鎂酸鹽的鎂-鹵素交換來製備具有化學式 (VIa) 之有機金屬化合物係熟習該項技術者已知的，並且在合成化學教科書如《馬奇氏高級有機化學》(March's Advanced Organic Chemistry) 中有所描述。

【0066】 如流程 5 所示，具有化學式 (II) 之羧酸可以藉由各種方法製備並且許多係可商購的。在用於其製備的許多報導的方法中，以下已被廣泛應用：



流程 5

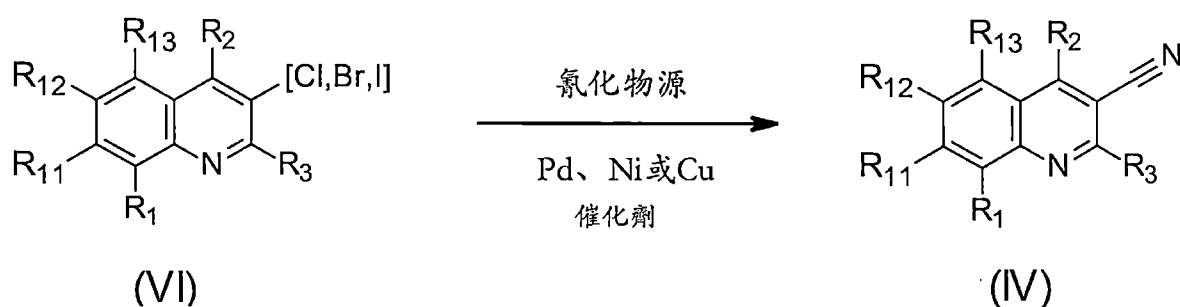
1) 如在 US 20070015758 中所述，藉由在惰性溶劑如二苯醚中、在 $100^{\circ}\text{C}$  和 $260^{\circ}\text{C}$  之間的溫度下，與具有化學式 (VIIa) 之丙二酸酯衍生物反應將具有化學式 (VI) 之苯胺轉化為具有化學式 (VIIb) 之喹諾酮 (quinolone)，隨後係熟習該項技術者通常已知的且還描述於 WO 2007133637 中的公知的官

能團相互轉化。

2) 在醚溶劑如 THF 中、在 $-90^{\circ}\text{C}$  和 $+20^{\circ}\text{C}$  之間的溫度下，藉由與烷基鋰試劑如三級丁基鋰的鋰-鹵素交換或與三正丁基鎂酸鹽的鎂-鹵素交換將具有化學式 (VI) 之化合物轉化為具有化學式 (VIa) 之有機金屬中間體，隨後與  $\text{CO}_2$  反應。

3) 如美國化學會志 (J. Am. Chem. Soc.) 2013, 2891-2894 (和其中的參考文獻) 或四面體 (Tetrahedron) 2003, 8629-8640 中所述，在一氧化碳源，鹼如三乙胺，水或其等效物和適當連接的含有例如鈀的過渡金屬催化劑存在下，轉化具有化學式 (VI) 之化合物。

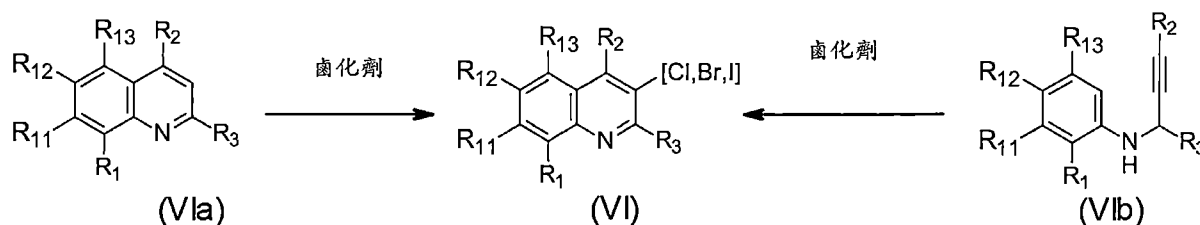
【0067】 如流程 6 所示，在鈀、鎳或銅催化劑存在下，在惰性溶劑如 DMF 中，在  $20^{\circ}\text{C}$  和  $150^{\circ}\text{C}$  之間的溫度下，可以藉由用氰化物源如氰化鋅處理，從具有化學式 (VI) 之化合物製備具有化學式 (IV) 之化合物，如在有機化學雜誌 (J. Org. Chem.) 2011, 665-668 或日本化學學會通報 (Bull. Chem. Soc. Jpn.) 1993, 2776-8 中所述。



流程 6

【0068】 如流程 7 所示，可以藉由在惰性溶劑中用鹵化劑如 N-碘代琥珀醯亞胺、溴或氯處理具有化學式 (VIa) 之化合物來製備具有化學式 (VI) 之化合物，如 WO 2005113539 或 JP 2001322979 中所述。可替代地，可以在

0°C 至 80°C 之間的溫度下，藉由用鹵化劑如碘在惰性溶劑如乙腈和鹼如碳酸氫鈉中處理具有化學式 (VIb) 之炔丙基化苯胺來製備具有化學式 (VI) 之化合物，如在有機快報 (Org. Lett.) 2005, 763-766 中所述。

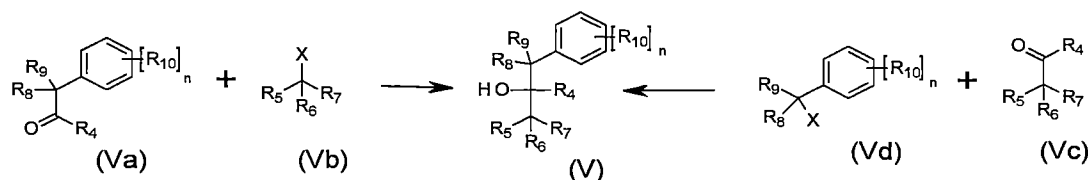


流程 7.

【0069】 從相應的可商購的苯胺製備具有化學式 (VIb) 之炔丙基化苯胺對於熟習該項技術者係簡單的並描述於《馬奇氏高級有機化學》(March's Advanced Organic Chemistry), 史密斯和馬奇 (Smith and March), 第六版, 威利 (Wiley), 2007 中。

【0070】 具有化學式 (VIa) 之化合物的合成通常是熟習該項技術者已知的，並且大量化合物係可商購的。

【0071】 如流程 8 所示，在惰性溶劑如乙醚中、在 -90°C 至 60°C 之間的溫度下，藉由分別用具有化學式 (Vb) 或 (Vd) (其中 X 係鋰、鋁或鎂鹽) 的有機金屬物質處理具有化學式 (Va) 或 (Vc) 之羰基化合物來製備具有化學式 (V) 之化合物。



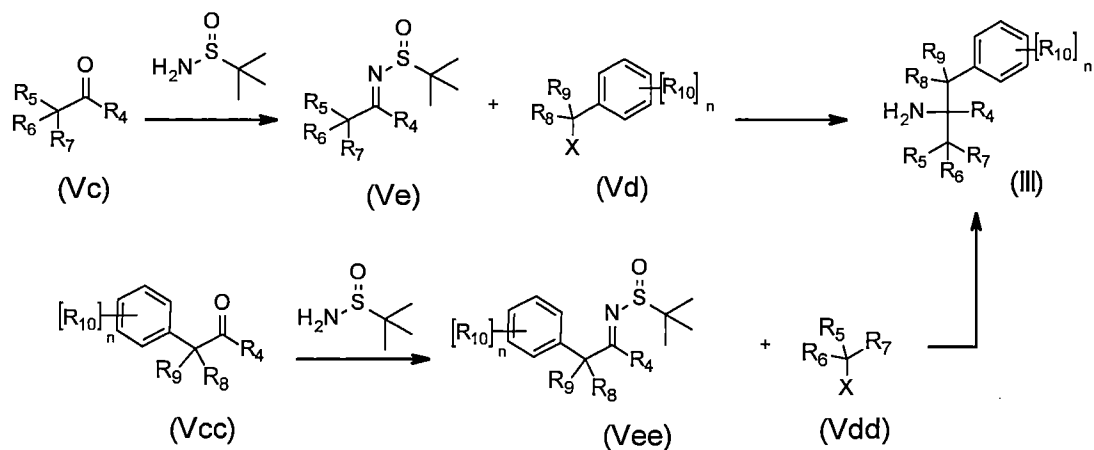
流程 8

【0072】 具有化學式 (Vb) 和 (Vd) 之試劑的一般製備、處理和反應

性描述於《馬奇氏高級有機化學》(*March's Advanced Organic Chemistry*)，史密斯和馬奇 (Smith and March)，第六版，威利 (Wiley)，2007 中並且係熟習該項技術者已知的。大量的具有化學式 (Va) 和 (Vc) 之化合物 (其中  $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、和  $R_{10}$  係如上所定義的) 也是可商購的並且它們的合成很好地描述於科學文獻和合成化學教科書 (如《馬奇氏高級有機化學》(*March's Advanced Organic Chemistry*)) 中並且此外，對於熟習該項技術者來說是公知的。

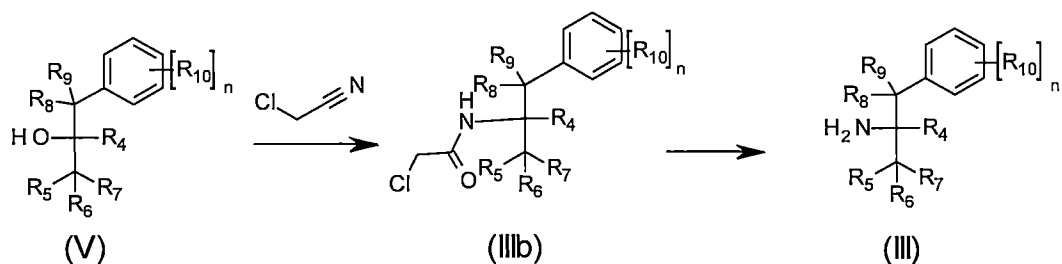
【0073】 如流程 9 所示，在惰性溶劑如 THF 中，在  $-78^\circ\text{C}$  和  $+70^\circ\text{C}$  之間的溫度下，可以由具有化學式 (Vc) 之化合物在諸如  $\text{Ti}(\text{OEt})_4$  的脫水劑存在下藉由與三級丁基亞磺醯胺縮合形成具有化學式 (Ve) 之硫亞胺，然後可以將其用具有化學式 (Vd) (其中 X 係鋰、鋁或鎂鹽) 的有機金屬試劑進行處理，隨後進行磺醯胺的酸性水解，來製備具有化學式 (III) 之胺；該順序通常是熟習該項技術者已知的並且也描述於《化學綜述》(*Chem. Rev.*) 2010, 3600-3740 中。

【0074】 可替代地，在惰性溶劑如 THF 中，在  $-78^\circ\text{C}$  和  $+70^\circ\text{C}$  之間的溫度下，可以由具有化學式 (Vcc) 之化合物在諸如  $\text{Ti}(\text{OEt})_4$  的脫水劑存在下藉由與三級丁基亞磺醯胺縮合形成具有化學式 (Vee) 之硫亞胺，然後可以將其用具有化學式 (Vdd) (其中 X 係鋰、鋁或鎂鹽) 的有機金屬試劑進行處理，隨後進行磺醯胺的酸性水解，來製備具有化學式 (III) 之胺。



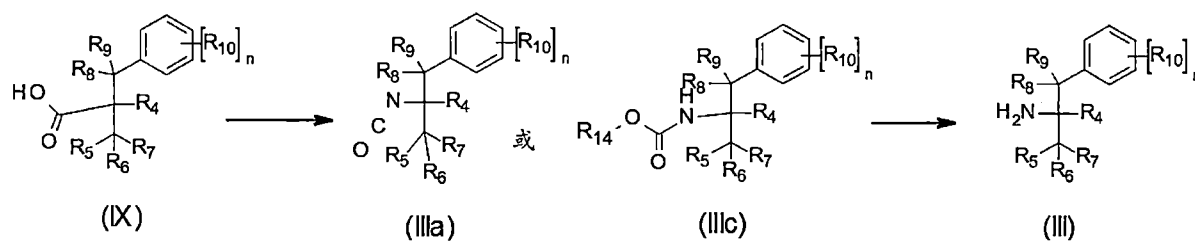
流程 9

【0075】 可替代地，還可以由具有化學式 (V) 之醇在有機溶劑如乙酸中、在氯乙腈的存在下、在-10°C 至 50°C 的溫度下用強酸如硫酸處理得到具有化學式 (IIIb) 之醯胺，該醯胺可以在有機溶劑如乙醇或乙酸中在 20°C 至 100°C 之間的溫度下用硫尿素去保護，來製備具有化學式 (III) 之胺，如在合成 (*Synthesis*) 2000, 1709-1712 中所述並示於流程 10 中。



流程 10

【0076】 可替代地，具有化學式 (III) 之胺也可以藉由具有化學式 (IIIa) 之中間體異氰酸酯或具有化學式 (IIIc) 之胺基甲酸酯（其中 R<sub>14</sub> 係 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基，其可以在 0°C 至 100°C 之間的溫度下用酸或鹼水溶液進行水解）從具有化學式 (IX) 之羧酸製備，如流程 11 所示。



流程 11

【0077】 在關於將酸 (IX) 轉化為異氰酸酯 (IIIa) 所報導的各種流程中，以下已得到廣泛應用：

1) 在惰性有機溶劑如甲苯中、在 50°C 和 120°C 之間的溫度下，用二苯基磷醯基疊氮化物和胺鹼如三丁胺處理酸 (IX)，得到異氰酸酯 (IIIa)，如在《澳大利亞化學雜誌》(*Aust. J. Chem.*) 1973，1591-3 中所述。

2) 在疊氮化物源如疊氮化鈉和胺鹼如三乙胺存在下，在惰性溶劑如 THF 中，在 20°C 至 100°C 之間的溫度下，用活化劑如亞硫醯氯或丙基膦酸酐處理酸 (IX)，如在合成 (*Synthesis*) 2011，1477-1483 中所述。

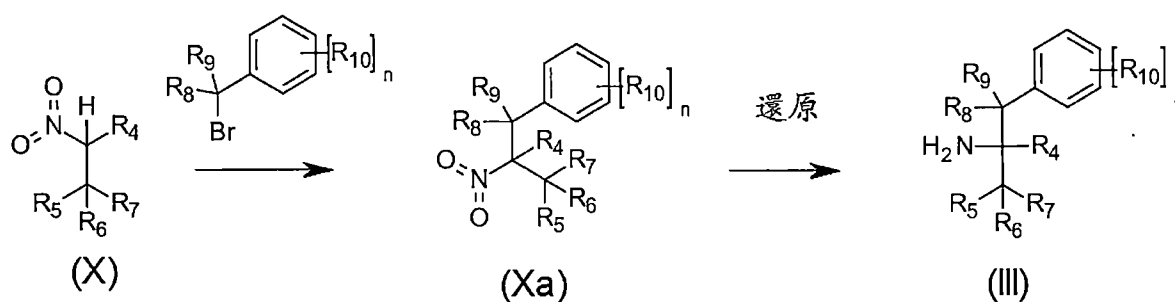
3) 將酸 (IX) 轉化為相應的異脛脲酸，然後可以用脫水劑如對甲苯磺醯氯和鹼如三乙胺、在惰性有機溶劑如甲苯中、在 20°C 至 120°C 之間的溫度下處理。

4) 將酸 (IX) 轉化成相應的一級羧醯胺，然後可以將該一級羧醯胺用氧化劑 (如二乙醯氧基碘苯) 和酸 (如三氟乙酸或對甲苯磺酸)、在溶劑 (如乙腈) 中、在 0°C 至 100°C 之間的溫度下進行處理，如在有機化學雜誌 (*J. Org. Chem.*) 1984，4212-4216 中所述。

5) 將酸 (IX) 轉化為相應的一級羧醯胺，然後可以將該一級羧醯胺在 0°C 至 100°C 之間的溫度下、在溶劑 (如水或甲醇) 中，用氧化劑 (如溴) 和鹼 (如氫氧化鈉) 處理。

【0078】 熟習該項技術者將理解，具有化學式 (IX) 之羧酸可以由相應的酯製備。類似地，熟習該項技術者將理解，可以藉由用強鹼如二異丙基胺鋰在惰性溶劑如 THF 中在  $-78^{\circ}\text{C}$  至  $20^{\circ}\text{C}$  之間的溫度下脫質子化來對該等酯的  $\alpha$  位置進行官能化，然後與親電子試劑如烷基碘反應，如在《馬奇氏高級有機化學》(March's Advanced Organic Chemistry)，史密斯和馬奇 (Smith and March)，第六版，威利 (Wiley)，2007 中所述。可以重複該反應以從可商購的酯製備具有化學式 (IX) 之酸。

【0079】 可替代地，也可以藉由用還原劑如鐵，在有機溶劑如乙酸中，在  $20^{\circ}\text{C}$  至  $120^{\circ}\text{C}$  之間的溫度下，還原具有化學式 (Xa) 之硝基化合物來製備具有化學式 (III) 之胺，如流程 12 所示。可以轉而藉由在惰性溶劑如己烷中，在銅催化劑存在下，在  $20^{\circ}\text{C}$  和  $100^{\circ}\text{C}$  之間的溫度下，用苄基溴和鹼如三級丁醇鈉處理，由簡單的具有化學式 (X) 之硝基化合物來製備具有化學式 (Xa) 之硝基化合物，如在美國化學會志 (*J. Am. Chem. Soc.*) 2012，9942-9945 中所述。

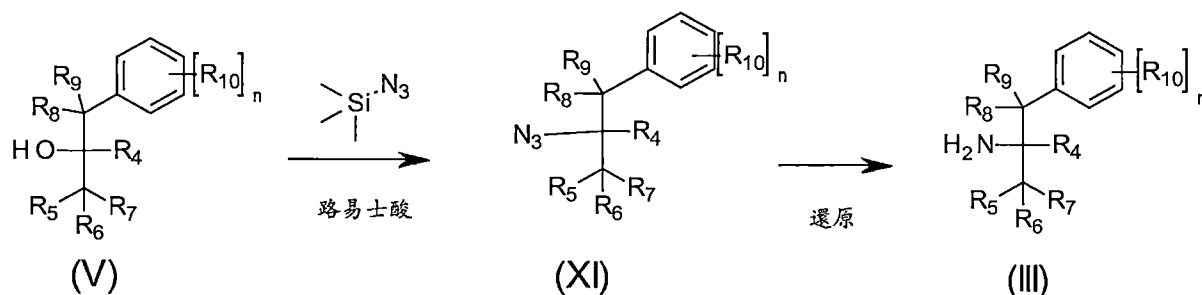


流程 12

【0080】 具有化學式 (X) 之化合物的合成通常是熟習該項技術者已知的，並且大量化合物係可商購的。

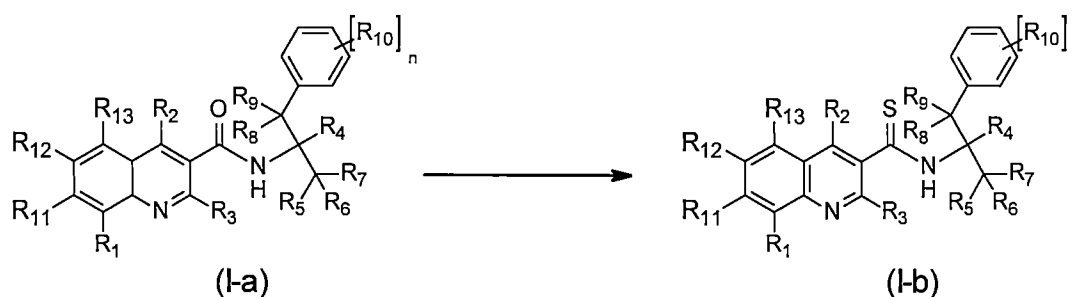
【0081】 可替代地，如在美國化學會志 (*J. Am. Chem. Soc.*) 2015，

9555-9558 中所述，還可以藉由在惰性溶劑如甲苯中，在 0°C 至 100°C 之間的溫度下，用三甲基甲矽烷基疊氮化物和路易斯酸催化劑如  $B(C_6F_6)_3$  處理具有化學式 (V) 之化合物來製備具有化學式 (III) 之胺，然後在有機溶劑如甲醇中，在 0°C 至 80°C 之間的溫度下，用還原劑如氫/鈀還原具有化學式 (XI) 之中間疊氮化物，如流程 13 所示。



流程 13

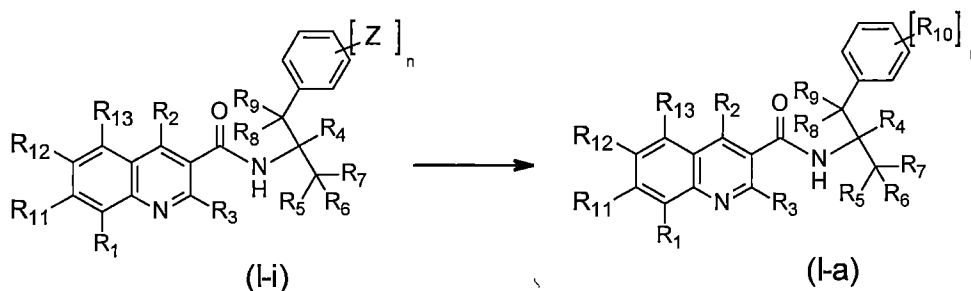
【0082】 如流程 14 所示，在 20°C 和 150°C 之間的溫度下，在惰性有機溶劑如甲苯中，可以藉由用去氧硫化劑如  $P_4S_{10}$  或勞氏試劑 (Lawesson reagent) 處理，從具有通式 (I-a) 之化合物 (其中 X 為 O) 來製備具有通式 (I-b) 之化合物 (其中 X 為 S)。



流程 14

【0083】 可替代地，具有化學式 (I-a) 之化合物 (其中  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 、 $R_{13}$  以及  $n$  係如對於具有化學式 (I) 之化合物所定義的並且  $X$  係 O) 可以藉由在鹼存在或不存在下，並且在偶合試劑和金屬催化劑存在下轉化具有化學式 I-i 的化合物 (其中  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、

$R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 、 $R_{13}$  以及  $n$  係如對於化學式 (I) 所定義的並且  $X$  係 O 並且  $Z$  表示溶劑中的氯、溴或碘) 來獲得。針對偶合劑、催化劑、溶劑和鹼不存在特別的限制，只要是在普通偶合反應中使用的，例如在“交叉偶合反應:實用指南(當代化學專題)(Cross-Coupling Reactions: A Practical Guide (Topics in Current Chemistry))”，諾裡奧宮浦(Norio Miyaur) 和 S.L 布赫瓦爾德(Buchwald) 編輯(施普林格(Springer) 版本)，或“金屬催化的交叉偶合反應(Metal-Catalyzed Cross-Coupling Reactions)”，阿明德弗裡斯(Armin de Meijere) 和 弗朗索瓦德里奇(François Diederich) 編輯(WILEY-VCH 版本) 中所描述的那些。這示於流程 15 中。



流程 15

**【0084】** 可替代地，具有化學式 (I-a) 之化合物(其中  $R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 、 $R_{13}$  以及  $n$  係如對於具有化學式 (I) 之化合物所定義的並且  $X$  係 O) 可以藉由使用熟習該項技術者已知的標準合成技術轉化另一種密切相關的具有化學式 (I-a) 化合物而獲得。非詳盡實例包括氧化反應、還原反應、水解反應、偶合反應、芳香族親核或親電子取代反應、親核取代反應、親核加成反應、以及鹵化反應。

**【0085】** 以上流程中所述的某些中間體係新穎的並且如此形成本發明另一個方面。

【0086】 具有化學式 (I) 之該等化合物可以例如作為活性成分用於農業和相關領域，來控制植物害蟲或用於非生物材料上來控制腐敗微生物或潛在地對人類有害的生物。該新穎化合物的特色係使用比率低但活性高，植物耐受良好以及不危害環境。它們有非常有用的治療的、預防的和系統性的特質並且可以用於保護無數栽培植株。具有化學式 (I) 之化合物可以用於抑制或破壞在多種不同的有用植物作物的植物或植物部分（果實、花、葉子、莖、塊莖、根）上發生的有害生物，同時還保護了例如稍後生長的那些植物部分免於致植物病的微生物。

【0087】 還能使用具有化學式 (I) 之化合物作為殺真菌劑。如本文中使用的，術語“殺真菌劑”係指控制、修飾或防止真菌生長的化合物。術語“殺真菌有效量”意指能夠產生對真菌生長的影響的這樣一種化合物或此類化合物的組合的量。控制或修飾的影響包括所有從自然發展的偏離，例如殺死、阻滯等，並且防止包括在植物內或上面防止真菌感染的屏障或其他防禦構造。

【0088】 也可以將具有化學式 (I) 之化合物作為處理植物繁殖材料（如種子，例如果實、塊莖、或穀物）、或植物插條（如大米）的拌種劑，用於保護對抗真菌感染或土壤裡的致植物病的真菌。可以在種植之前將繁殖材料用包括具有化學式 (I) 之化合物的組成物處理，例如可以在播種之前敷裹種子。還可以藉由在液體配製物中浸漬種子或藉由用固體配製物包衣它們，從而將具有化學式 (I) 之化合物施用至穀物（包衣）。還可以在種植該繁殖材料時，將該組成物施用至種植位點，例如在播種期間施用至種子的犁溝。本發明還涉及處理植物繁殖材料的這樣的方法，並且涉及如此

處理的植物繁殖材料。

【0089】 此外，根據本發明所述的該等化合物可以用於控制相關領域的真菌，該等領域係例如在工業材料（包括木材以及與木材有關的工業產品）的保護中、在食品存儲中、在衛生管理中。

【0090】 此外，本發明還可以用於保護非生命材料（例如木料、牆板和塗料）免受真菌攻擊。

【0091】 具有化學式 (I) 之化合物和含有它們的殺真菌組成物可以用於控制由廣泛的真菌植物病原體引起的植物疾病。它們有效地控制廣泛的植物疾病，如觀賞植物、草皮、蔬菜、大田、穀類、以及水果作物的葉病原體。

【0092】 可以被控制的疾病的該等真菌和真菌載體連同致植物病細菌和病毒係例如：

傘枝梨頭黴 (*Absidia corymbifera*)、鏈格孢屬 (*Alternaria* spp)、絲囊黴屬 (*Aphanomyces* spp)、殼二孢屬 (*Ascochyta* spp)、麴黴屬 (*Aspergillus* spp.) (包括黃麴黴 (*A. flavus*)、煙麴黴 (*A. fumigatus*)、構巢麴黴 (*A. nidulans*)、黑麴黴 (*A. niger*)、土麴黴 (*A. terreus*))、短梗黴屬 (*Aureobasidium* spp.) (包括出芽短梗黴 (*A. pullulans*))、皮炎芽生菌 (*Blastomyces dermatitidis*)、小麥白粉病菌 (*Blumeria graminis*)、萵苣盤梗黴 (*Bremia lactucae*)、葡萄座腔菌屬 (*Botryosphaeria* spp.) (包括葡萄潰瘍病菌 (*B. dothidea*)、樹花地衣葡萄座腔菌 (*B. obtusa*))、葡萄孢屬 (*Botrytis* spp.) (包括灰葡萄孢 (*B. cinerea*))、假絲酵母屬 (*Candida* spp.) (包括白色念珠菌、光滑球念珠菌 (*C. glabrata*)、克魯斯念珠菌 (*C. krusei*)、葡萄牙念珠菌 (*C. lusitaniae*)、近平滑念珠菌

(*C.parapsilosis*)、熱帶念珠菌 (*C.tropicalis*)、*Cephaloascus fragrans*、長喙殼屬、尾孢屬 (包括褐斑病菌 (*C. arachidicola*))、晚斑病菌 (*Cercosporidium personatum*)、枝孢黴屬 (*Cladosporium spp*)、麥角菌 (*Claviceps purpurea*)、

粗球孢子菌 (*Coccidioides immitis*)、旋孢腔菌屬 (*Cochliobolus spp*)、炭疽菌屬 (*Colletotrichum spp.*) (包括香蕉炭疽病菌 (*C. musae*))、

新型隱球菌 (*Cryptococcus neoformans*)、間座殼屬 (*Diaporthe spp*)、亞隔孢殼屬 (*Didymella spp*)、內臍蠕孢屬 (*Drechslera spp*)、痂囊腔菌屬 (*Elsinoe spp*)、

表皮癬菌屬 (*Epidermophyton spp*)、梨火疫病菌 (*Erwinia amylovora*)、白粉菌屬 (*Erysiphe spp.*) (包括菊科白粉菌 (*E. cichoracearum*))、

葡萄頂枯病菌 (*Eutypa lata*)、鐮刀菌屬 (*Fusarium spp.*) (包括大刀鐮刀菌 (*F. culmorum*)、禾穀鐮刀菌 (*F. graminearum*)、*F.鐮刀菌* (*F. langsethiae*)、串珠鐮刀菌 (*F. moniliforme*)、膠孢鐮刀菌 (*F. oxysporum*)、茄病鐮刀菌 (*F. proliferatum*)、尖孢鐮刀菌 (*F. subglutinans*)、層出鐮刀菌 (*F. solani*))、小麥全蝕病菌 (*Gaeumannomyces graminis*)、藤倉赤黴菌 (*Gibberella fujikuroi*)、煤煙病菌 (*Gloeodes pomigena*)、香蕉炭疽盤長孢菌 (*Gloeosporium musarum*)、蘋果炭疽病菌 (*Glomerella cingulate*)、葡萄球座菌 (*Guignardia bidwellii*)、植物受檜膠鏽菌 (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*)、長蠕孢屬、駝孢鏽菌屬、組織胞漿菌屬 (包括莢膜組織胞漿菌 (*H. capsulatum*))、紅線病菌、*Leptographium lindbergi*、辣椒白粉病菌 (*Leveillula taurica*)、松針散盤殼 (*Lophodermium seditiosum*)、雪黴葉枯菌 (*Microdochium nivale*)、小孢子菌屬、鏈核盤菌屬、毛黴屬、球腔菌屬 (包括禾生球腔菌、蘋果黑點病菌 (*M.*

pomi))、樹梢枯病菌、雲杉病菌、副球孢子菌屬、青黴屬(包括指狀青黴、義大利青黴)、黴樣真黴屬、指霜黴屬(包括玉蜀黍指霜黴、菲律賓霜指黴、高粱指霜黴)、霜黴屬、穎枯殼針孢、豆薯層鏽菌、桑黃火木針層孔菌(*Phellinus igniarius*)、瓶黴蟻屬、莖點黴屬、葡萄生擬莖點菌(*Phomopsis viticola*)、疫黴菌屬(包括致病疫黴菌)、單軸黴屬(包括霍爾斯單軸黴菌、葡萄霜黴病菌(*P. viticola*))、格孢腔菌屬、叉絲單囊殼屬(包括白叉絲單囊殼(*P. leucotricha*))、禾穀多黏菌(*Polymyxa graminis*)、甜菜多黏菌(*Polymyxa betae*)、小麥基腐病菌(*Pseudocercospora herpotrichoides*)、假單胞菌屬、霜黴屬(包括大麥柄鏽菌(*P. hordei*)、小麥葉銹病菌(*P. recondita*)、條形柄鏽菌(*P. Striiformis*)、小麥褐鏽菌(*P. triticina*))、埋核盤菌屬、核腔菌屬、梨孢屬(包括稻瘟病菌(*P. oryzae*))、腐黴屬(包括終極腐黴菌)、柱隔孢屬、絲核菌屬、微小根毛黴(*Rhizomucor pusillus*)、少根根黴、喙孢屬、絲孢菌屬(包括尖端賽多孢子菌和多育賽多孢子菌)、煤點病(*Schizothyrium pomi*)、

核盤菌屬、小核菌屬、殼針孢屬(包括穎枯殼針孢(*S. nodorum*)、小麥殼針孢(*S. tritici*))、草莓白粉病菌(*Sphaerotheca macularis*)、棕絲單囊殼(*Sphaerotheca fusca*)、黃瓜白粉病菌(*Sphaerotheca fuliginea*)、孢子絲菌屬(*Sporothrix*)、穎枯殼多孢(*Stagonospora nodorum*)、匍柄黴屬(*Stemphylium*)、毛韌革菌(*Stereum hirsutum*)、水稻枯紋病菌(*Thanatephorus cucumeris*)、根串珠黴(*Thielaviopsis basicola*)、腥黑粉菌屬(*Tilletia* spp)、木黴屬(*Trichoderma* spp.) (包括哈茨木黴(*T. harzianum*))、擬康氏木黴(*T. pseudokoningii*)、綠色木黴(*T. viride*))、

毛癬菌屬、核瑚菌屬、葡萄鉤絲殼、條黑粉菌屬 (*Urocystis*)、黑粉菌屬 (*Ustilago*)、黑星菌屬 (包括蘋果黑星菌 (*V. inaequalis*))、輪枝孢屬、以及黃單胞菌屬。

【0093】 具體地，具有化學式 (I) 之化合物和含有它們的殺真菌組成物可以用於控制由擔子菌綱、子囊菌綱、卵菌綱和/或半知菌綱、Blasocladiomycete、壺菌綱、球囊菌綱 (*Glomeromycete*) 和/或粒毛盤菌綱 (*Mucoromycete*) 中的廣譜的真菌植物病原體引起的植物疾病。

【0094】 該等病原體可以包括：

卵菌綱，包括疫黴病，如由辣椒疫黴菌、致病疫黴菌、大豆疫黴菌、草莓疫菌 (*Phytophthora fragariae*)、煙草疫黴菌 (*Phytophthora nicotianae*)、樟疫黴 (*Phytophthora cinnamomi*)、柑橘生疫黴 (*Phytophthora citricola*)、柑桔褐腐疫黴 (*Phytophthora citrophthora*) 和馬鈴薯緋腐病菌 (*Phytophthora erythroseptica*) 引起的那些；腐黴病，例如由瓜果腐黴菌、強雄腐黴菌 (*Pythium arrhenomanes*)、禾草腐黴菌、畸雌腐黴菌 (*Pythium irregulare*) 和終極腐黴菌引起的那些；由霜黴目諸如大蔥霜黴菌 (*Peronospora destructor*)、白菜霜黴菌、葡萄霜黴菌、向日葵霜黴菌、黃瓜霜黴菌、白鏽菌 (*Albugo Candida*)、水稻霜黴病和萵苣霜黴菌引起的疾病；以及其他，例如螺殼狀絲囊黴、*Labyrinthula zosterae*、高粱霜指黴 (*Peronosclerospora sorghi*) 和禾生指梗黴 (*Sclerospora graminicola*)。

【0095】 子囊菌綱，包括斑紋病、斑點病、瘟病或疫病和/或腐病，例如由如下引起的那些：格孢菌目諸如大蒜白斑病菌 (*Stemphylium solani*)、*Stagonospora tainanensis*、*Spilocaea oleaginea*、玉米大斑病菌 (*Setosphaeria*

*turcica* )、*Pyrenochaeta lycopersici*、枯葉格孢腔菌、實腐莖點黴 (*Phoma destructiva* )、*Phaeosphaeria herpotrichoides*、*Phaeocryptococcus gaeumannii*、*Ophiosphaerella graminicola*、小麥全蝕病菌 (*Ophiobolus graminis*)、十字花科小球腔菌 (*Leptosphaeria maculans*)、軟腐病菌 (*Hendersonia creberrima*)、殼針孢葉枯病菌 (*Helminthosporium tritici-repentis*)、玉米大斑病菌 (*Setosphaeria turcica*)、大豆內臍蠕孢 (*Drechslera glycines*)、西瓜蔓枯病菌 (*Didymella bryoniae*)、*Cyloconium oleagineum*、多主棒孢菌、禾旋孢腔菌、火龍果黑斑病菌 (*Bipolaris cactivora*)、蘋果黑星病菌、圓核腔菌、燕麥草核腔菌 (*Pyrenophora tritici-repentis*)、互隔鏈格孢菌、萎萎鏈格孢菌 (*Alternaria brassicicola*)、茄鏈格孢菌和番茄鏈格孢菌 (*Alternaria tomatophila*)，煤炱目 (*Capnodiales*) 諸如 小麥殼針孢、穎枯殼針孢、大豆殼針孢 (*Septoria glycines*)、落花生尾孢菌 (*Cercospora arachidicola*)、大豆灰斑病菌、玉米灰斑病菌、薺白斑病菌 (*Cercospora capsellae*) 以及麥葉白黴 (*Cercospora herpotrichoides*)、桃瘡痂病菌 (*Cladosporium carpophilum*)、散生枝孢 (*Cladosporium effusum*)、褐孢黴 (*Passalora fulva*)、尖孢枝孢 (*Cladosporium oxysporum*)、*Dothistroma septosporum*、葡萄褐斑病菌 (*Isariopsis clavispora*)、香蕉黑條葉斑病菌、禾生球腔菌 (*Mycosphaerella graminicola*)、*Mycovellosiella koepkei*、*Phaeoisariopsis bataticola*、葡萄褐斑病菌 (*Pseudocercospora vitis*)、小麥基腐病菌、甜菜葉斑病菌、柱隔孢葉斑病菌 (*Ramularia collo-cygni*)、冀殼菌目諸如燕麥全蝕病菌、稻瘟病菌 (*Magnaporthe grisea*)、稻梨孢、間座殼目諸如榛子東部枯萎病菌、*Apiognomonium errabunda*、*Cytospora platani*、大豆北方莖潰瘍病菌、毀滅性座盤孢 (*Discula destructiva*)、草莓日規殼菌

(*Gnomonia fructicola*)、葡萄苦腐病菌、核桃黑盤殼菌 (*Melanconium juglandinum*)、葡萄生擬莖點菌 (*Phomopsis viticola*)、*Sirococcus clavigignenti-juglandacearum*、*Tubakia dryina*、*Dicarpella* spp.、蘋果樹腐爛病菌 (*Valsa ceratosperma*)，以及其他諸如 *Actinothyrium graminis*、黃麴黴、煙麴黴、構巢麴黴、番木瓜座糙孢菌 (*Asperisporium caricae*)、葉斑病菌 (*Blumeriella jaapii*)、假絲酵母屬、念珠菌屬、煤炱病菌 (*Capnodium ramosum*)、*Cephalosascus* spp.、麥類條斑病菌 (*Cephalosporium gramineum*)、奇異長喙殼 (*Ceratocystis paradoxa*)、毛殼菌屬、*Hymenoscyphus pseudoalbidus*、球孢子菌屬、李屬柱孢黴 (*Cylindrosporium padi*)、*Diplocarpon malae*、*Drepanopeziza campestris*、痂囊腔菌 (*Elsinoe ampelina*)、黑附球菌、表皮癬菌屬、葡萄藤猝倒病菌、白地黴、小麥稈枯病菌 (*Gibellina cerealis*)、高粱膠尾孢 (*Gloeocercospora sorghi*)、煤煙病菌 (*Gloeodes pomigena*)、*Gloeosporium perennans*；*Gloeotinia temulenta*、*Griphosphaeria corticola*、利尼球梗孢 (*Kabatiella lini*)、*Leptographium microsporum*、*Leptosphaerulina crassiasca*、*Lophodermium seditiosum*、*Marssonina graminicola*、雪黴葉枯菌、美澳型核果褐腐病菌、*Monographella albescens*、甜瓜黑點根腐病菌、*Naemacyclus* spp.、新榆枯萎病菌、巴西副球孢子菌、擴展青黴、*Pestalotia rhododendri*、黴樣真黴屬 (*Petriellidium*)、無柄盤菌屬、大豆莖褐腐病菌、*Phyllachora pomigena*、雜食動物瘤梗孢 (*Phymatotrichum omnivora*)、隱秘囊孢菌 (*Physalospora abdita*)、煙草囊孢殼 (*lectosporium tabacinum*)、馬鈴薯皮斑病菌、苜蓿假盤菌 (*Pseudopeziza medicaginis*)、蠶蟄埋核盤菌 (*Pyrenopeziza brassicae*)、高粱座枝孢 (*Ramulispora sorghi*)、*Rhabdocline pseudotsugae*、大麥雲紋病菌 (*Rhynchosporium secalis*)、稻帚枝杆

孢 (*Sacrocladium oryzae*)、足放線病菌屬 (*Scedosporium*)、煤點病、核盤菌、小核盤菌；小核菌屬、雪腐病核瑚菌 (*Typhula ishikariensis*)、瑪麗盤雙端毛孢 (*Seimatosporium mariae*)、*Leptotypha cupressi*、*Septocytia ruborum*、*Sphaceloma perseae*、*Sporonema phacidioides*、*Stigmata palmivora*、*Tapesia yallundae*、梨外囊菌 (*Taphrina bullata*)、*Thielviopsis basicola*、*Trichoseptoria fructigena*、蠅糞病菌 (*Zygothiala jamaicensis*)；白粉病，例如由白粉菌目諸如小麥白粉病菌、蓼白粉病菌、葡萄鉤絲殼、黃瓜白粉病菌 (*Sphaerotheca fuliginea*)、白叉絲單囊殼、*Podospaera macularis* 二孢白粉菌 (*Golovinomyces cichoracearum*)、辣椒白粉病菌 (*Leveillula taurica*)、擴散叉絲殼、*Oidiopsis gossypii*、榛球針殼 (*Phyllactinia guttata*) 以及 *Oidium arachidis* 引起的那些；黴，例如由葡萄座腔菌諸如小穴殼菌 (*Dothiorella aromatica*)、連續色二孢 (*Diplodia seriata*)、比德瓦裡球座菌 (*Guignardia bidwellii*)、灰葡萄孢菌、大蔥孢盤菌 (*Botryotinia allii*)、蠶豆孢盤菌 (*Botryotinia fabae*)、扁桃殼梭菌 (*Fusicoccum amygdali*)、龍眼焦腐病菌 (*Lasioidiplodia theobromae*)、茶生大莖點黴 (*Macrophoma theicola*)、菜豆殼球孢菌、葫蘆科葉點黴 (*Phyllosticta cucurbitacearum*) 引起的那些；炭疽病，例如小叢殼 (*Glomerellales*) 諸如盤長孢狀刺盤孢、瓜類炭疽菌、棉花炭疽病菌、圍小叢殼、以及禾生炭疽菌由引起的那些；以及枯萎病或疫病，例如由肉座菌目諸如筆直頂孢黴、紫麥角菌、黃色鐮刀菌、禾穀鐮刀菌、大豆猝死綜合症病菌 (*Fusarium virguliforme*)、尖孢鐮刀菌、膠孢鐮刀菌、古巴尖孢鐮孢 (*Fusarium oxysporum* f.sp. *cubense*)、*Gerlachia nivale*、藤倉赤黴、玉米赤黴、膠枝黴屬、疣孢漆斑菌、*Nectria ramulariae*、綠色木黴、粉紅聚端孢菌以及鱷梨根腐病原菌 (*Verticillium theobromae*) 引

起的那些。

【0096】擔子菌綱，包括黑穗病，例如由黑粉菌目諸如稻曲病菌、小麥散黑穗病菌、小麥散黑粉菌菌、玉米黑粉病菌引起的那些，銹病例如由柄鏽菌諸如 *Cerotelium fici*、雲杉帚銹病菌 (*Chrysomyxa arctostaphyli*)、番薯鞘鏽菌 (*Coleosporium ipomoeae*)、咖啡駝孢鏽菌 (*Hemileia vastatrix*)、落花生柄鏽菌、*Puccinia cacabata*、禾柄鏽菌、隱匿柄鏽菌、高粱柄鏽菌、大麥柄鏽菌、大麥條形柄鏽菌 (*Puccinia striiformis* f.sp. *Hordei*)、小麥條形柄鏽菌 (*Puccinia striiformis* f.sp. *Secalis*)、榛膨痂鏽菌 (*Pucciniastrum coryli*)，或鏽菌目諸如松胞銹病菌、植物受檜膠鏽菌 (*Gymnosporangium juniperi-virginianae*)、楊樹葉銹病菌 (*Melampsora medusae*)、豆薯層鏽菌 (*Phakopsora pachyrhizi*)、短尖多胞鏽菌 (*Phragmidium mucronatum*)、*Physopella ampelosis*、變色疣雙胞鏽菌 (*Tranzschelia discolor*) 以及蠶豆單胞鏽菌 (*Uromyces viciae-fabae*) 引起的那些；以及其他腐病和疾病，例如由隱球菌屬、茶餅病菌、*Marasmiellus inoderma*、小菇屬、絲黑穗病菌 (*Sphacelotheca reiliana*)、雪腐病核瑚菌 (*Typhula ishikariensis*)、冰草條黑粉菌 (*Urocystis agropyri*)、*Itersonilia perplexans*、*Corticium invisum*、*Laetisaria fuciformis*、*Waitea circinata*、立枯絲核菌、*Thanetophorus cucurmeris*、*Entyloma dahliae*、*Entylomella microspora*、沼濕草尾孢黑粉菌 (*Neovossia moliniae*) 和小麥網腥黑穗病菌 (*Tilletia caries*) 引起的那些。

Blastocladiomycete，如玉蜀黍節壺菌 (*Physoderma maydis*)。

粒毛盤菌綱 (Mucoromycete)，如筍瓜花腐病菌 (*Choanephora cucurbitarum*)；毛黴屬；少根根黴，

連同由與以上列出的那些緊密相關的其他物種和屬引起的疾病。

【0097】 除了它們的殺真菌活性之外，該等化合物和包括它們的組成物還可以具有針對細菌如梨火疫病菌、軟腐歐文氏菌 (*Erwinia caratovora*)、野油菜黃單胞菌、丁香假單胞菌、馬鈴薯瘡痂病菌 (*Streptomyces scabies*) 和其他相關物種連同某些原生動物的活性。

【0098】 在本發明的範圍內，有待保護的目標作物和/或有用植物典型地包括多年生和一年生作物，例如漿果植物，例如黑莓、藍莓、蔓越莓、樹莓以及草莓；穀類，例如大麥、玉米 (maize 或 corn)、小米、燕麥、水稻、黑麥、高粱、黑小麥以及小麥；纖維植物，例如棉花、亞麻、大麻、黃麻和劍麻；大田作物，例如糖甜菜和飼料甜菜、咖啡、啤酒花、芥菜、油菜 (卡諾拉 (canola))、罌粟、甘蔗、向日葵、茶以及煙草；果樹，例如蘋果、杏、鱷梨、香蕉、櫻桃、柑橘、油桃、桃、梨以及李子；草，例如百慕達草、藍草、本特草、蜈蚣草 (centipede grass)、牛毛草、黑麥草、聖奧古斯丁草以及結縷草；草本，例如羅勒、琉璃苣、細香蔥、胡荽、薰衣草、獨活草、薄荷、牛至、荷蘭芹、迷迭香、鼠尾草以及百里香；豆類，例如菜豆、小扁豆、豌豆和大豆；堅果，例如扁桃仁、腰果、落花生 (ground nut)、榛子、花生、美洲山核桃、開心果以及胡桃；棕櫚植物例如油棕；觀賞植物，例如花、灌木和樹；其他樹，例如可可、椰子、橄欖以及橡膠樹；蔬菜，例如蘆筍、茄子、花椰菜、捲心菜、胡蘿蔔、黃瓜、大蒜、生菜、西葫蘆、瓜、秋葵、洋蔥、辣椒、馬鈴薯、南瓜、大黃、菠菜以及番茄；以及藤本植物例如葡萄。

【0099】 根據本發明的有用植物和/或目標作物包括常規的連同遺傳

增強或遺傳工程處理的品種，例如像抗蟲的（例如 Bt.和 VIP 品種）連同抗病的、耐除草劑的（例如耐草甘膦和草丁膦的玉米品種，在商品名 RoundupReady®和 LibertyLink®下可商購）以及耐受線蟲的品種。藉由舉例的方式，適合的遺傳增強或遺傳工程處理的作物品種包括 Stoneville 5599BR 棉花和 Stoneville 4892BR 棉花品種。

【0100】 術語“有用植物”和/或“目標作物”應當理解為還包括由於常規育種方法或基因工程方法而賦予了對除草劑（像溴草腈）或除草劑類的（例如像 HPPD 抑制劑、ALS 抑制劑，如氟嘧磺隆、氟丙磺隆和三氟啶磺隆、EPSPS（5-烯醇-丙酮醯-莽草酸-3-磷酸-合成酶（5-enol-pyrovyl-shikimate-3-phosphate-synthase））抑制劑、GS（麩胺醯酸合成酶）抑制劑或 PPO（原卟啉原氧化酶）抑制劑）的耐受性的有用植物。已經藉由常規育種方法（誘變）變得對咪唑啉酮例如甲氧咪草煙具有耐受力的作物的實例係 Clearfield®夏季油菜（卡諾拉）。已經藉由基因工程方法使其對除草劑或除草劑類別的耐受的作物的實例包括抗草甘膦和抗草丁膦玉蜀黍品種，它們係在 RoundupReady®、Herculex I®和 LibertyLink®商標名下可商購的。

【0101】 術語“有用植物”和/或“目標作物”應被理解為包括天然地或已經賦予對有害昆蟲的抗性的那些。這包括藉由使用重組 DNA 技術轉化從而例如能夠合成一種或多種選擇性作用毒素的植物，該等毒素例如係從如產毒素的細菌已知的。可以被表現的毒素的實例包括  $\delta$ -內毒素，營養期殺昆蟲蛋白（Vip），細菌定殖線蟲的殺昆蟲蛋白質，以及由蠍子、蛛形綱動物、黃蜂和真菌產生的毒素。已經被修飾為表現蘇雲金芽孢桿菌毒素

的作物的實例係 Bt maize KnockOut® (先正達種子公司 (Syngenta Seeds))。包括編碼殺昆蟲抗性並且由此表現多於一種毒素的多於一種基因的作物的實例係 VipCot® (先正達種子公司)。作物或其種子材料還可以是對多種類型的有害生物具有抗性 (當藉由遺傳修飾產生時的所謂的疊加轉基因事件)。例如,植物可以具有表現殺昆蟲蛋白同時耐受除草劑的能力,例如 Herculex I® (陶氏益農公司 (Dow AgroSciences), 先鋒良種國際公司 (Pioneer Hi-Bred International))。

**【0102】** 術語“有用植物”和/或“目標作物”可以理解為也包括已經藉由使用重組 DNA 技術轉形了的,使該等植物能夠合成有選擇性活性的抗致病性物質,例如,所謂的“致病機理相關的蛋白”(PRPs,見例 EP-A-0 392 225)。例如,藉由 EP-A-0 392 225、WO 95/33818,和 EP-A-0 353 191,這種抗致病性物質和能夠合成這種抗致病性物質的轉基因植物的實例係已知的。生產這種轉基因植物的方法對精通藝術的人係來說是眾所周知的並且例如上面的出版物中有描述這種方法。

**【0103】** 可藉由轉基因植物表現的毒素包括,例如殺昆蟲蛋白質,例如來自於枯草芽孢桿菌或日本甲蟲芽孢桿菌的殺昆蟲蛋白質;或來自於蘇雲金芽孢桿菌的殺昆蟲蛋白質,例如  $\delta$ -內毒素,例如 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 或 Cry9C,或植物性殺昆蟲蛋白 (Vip),例如 Vip1、Vip2、Vip3 或 Vip3A;或線蟲寄生性細菌的殺昆蟲蛋白質,例如光杆狀菌屬或致病桿菌屬,例如發光光杆狀菌、嗜線蟲致病桿菌;由動物產生的毒素,例如蠍毒素、蜘蛛毒素、黃蜂毒素和其他昆蟲特異性神經毒素;由真菌產生的毒素,例如鏈黴菌毒素;植物凝集素,例如豌豆

凝集素、大麥凝集素或雪花蓮凝集素；凝集素類；蛋白酶抑制劑，例如胰蛋白酶抑制劑、絲胺酸蛋白酶抑制劑、馬鈴薯貯存蛋白（patatin）、半胱胺酸蛋白酶抑制劑、木瓜蛋白酶抑制劑；核糖體失活蛋白（RIP），例如蓖麻蛋白、玉米-RIP、相思豆毒蛋白、絲瓜籽毒蛋白、皂草毒素蛋白或異株瀉根毒蛋白；類固醇代謝酶，例如 3-羥基類固醇氧化酶、蛻皮類固醇-UDP-糖基-轉移酶、膽固醇氧化酶、蛻皮激素抑制劑、HMG-COA-還原酶，離子通道阻斷劑，例如鈉通道或鈣通道阻斷劑，保幼激素酯酶，利尿激素受體、芪合成酶、聯苳合成酶、幾丁酶和葡聚糖酶。

【0104】 另外，在本發明背景下， $\delta$ -內毒素例如 Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry1Fa2、Cry2Ab、Cry3A、Cry3Bb1 或 Cry9C，或營養期殺昆蟲蛋白（Vip），例如 Vip1、Vip2、Vip3 或 Vip3A 應理解為顯然還包括混合型毒素、截短的毒素和經修飾的毒素。混合型毒素係藉由那些蛋白的不同區域的新組合重組產生的（參見，例如 WO 02/15701）。截短的毒素例如截短的 Cry1Ab 係已知的。在經修飾毒素的情況下，天然產生的毒素的一個或多個胺基酸被置換。在這種胺基酸置換中，較佳的是將非天然存在的蛋白酶識別序列插入毒素中，例如在 Cry3A055 的情況下，組織蛋白酶-G-識別序列被插入 Cry3A 毒素（參見 WO 03/018810）。

【0105】 這樣的毒素或能夠合成這樣的毒素的轉基因植物的更多實例揭露於例如 EP-A-0 374 753、WO 93/07278、WO 95/34656、EP-A-0 427 529、EP-A-451 878 以及 WO 03/052073 中。

【0106】 用於製備這樣的轉基因植物的方法對於熟習該項技術者而言通常是已知的並且描述在例如以上提及的公開物中。CryI-型去氧核糖核

酸及其製備例如從 WO 95/34656、EP-A-0 367 474、EP-A-0 401 979 以及 WO 90/13651 中已知。

**【0107】** 包括在轉基因植物中的毒素使得植物對有害昆蟲有耐受性。該等昆蟲可以存在於任何昆蟲分類群，但尤其是通常在甲蟲（鞘翅目）、雙翅昆蟲（雙翅目）以及蝴蝶（鱗翅目）中發現。

**【0108】** 包含一種或多種編碼殺昆蟲劑抗性並且表現一種或多種毒素的基因的轉基因植物係已知的並且其中一些係可商購的。這樣的植物的實例係：YieldGard®（玉米品種，表現 Cry1Ab 毒素）；YieldGard Rootworm®（玉米品種，表現 Cry3Bb1 毒素）；YieldGard Plus®（玉米品種，表現 Cry1Ab 以及 Cry3Bb1 毒素）；Starlink®（玉米品種，表現 Cry9C 毒素）；Herculex I®（玉米品種，表現 Cry1Fa2 毒素以及實現對除草劑草丁膦銨的耐受性的酶磷絲菌素 N-乙醯轉移酶（PAT））；NuCOTN 33B®（棉花品種，表現 Cry1Ac 毒素）；Bollgard I®（棉花品種，表現 Cry1Ac 毒素）；Bollgard II®（棉花品種，表現 Cry1Ac 和 Cry2Ab 毒素）；VipCot®（棉花品種，表現 Vip3A 和 Cry1Ab 毒素）；NewLeaf®（馬鈴薯品種，表現 Cry3A 毒素）；NatureGard®，Agrisure® GT Advantage（GA21 耐草甘膦性狀），Agrisure® CB Advantage（Bt11 玉米螟（CB）性狀）以及 Protecta®。

**【0109】** 這樣的轉基因作物的其他實例係：

1. Bt11 玉米，來自先正達種子公司（Syngenta Seeds SAS），霍比特路（Chemin de l' Hobit）27，F-31 790 聖蘇維爾（St. Sauveur），法國，登記號 C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉蜀黍，藉由轉基因表現截短的 Cry1Ab 毒素，使之能抵抗歐洲玉米螟（玉米螟和粉莖螟）的侵襲。Bt11 玉米還轉基因地

表現 PAT 酶以達到對除草劑草丁膦銨的耐受性。

2. Bt176 玉米，來自先正達種子公司 (Syngenta Seeds SAS)，霍比特路 (Chemin de l' Hobit) 27，F-31 790 聖蘇維爾 (St. Sauveur)，法國，登記號 C/FR/96/05/10。遺傳修飾的玉蜀黍，藉由轉基因表現 Cry1Ab 毒素，使之能抵抗歐洲玉米螟(玉米螟和粉莖螟)的侵襲。Bt176 玉米還轉基因地表現 PAT 酶以達到對除草劑草丁膦銨的耐受性。

3. MIR604 玉米，來自先正達種子公司 (Syngenta Seeds SAS)，霍比特路 (Chemin de l' Hobit) 27，F-31 790 聖蘇維爾 (St. Sauveur)，法國，登記號 C/FR/96/05/10。藉由轉基因表現經修飾的 Cry3A 毒素使之具有昆蟲抗性的玉米。此毒素係藉由插入組織蛋白酶-G-蛋白酶識別序列而經修飾的 Cry3A055。此類轉基因玉米植物的製備描述於 WO 03/018810 中。

4. MON 863 玉米，來自孟山都歐洲公司 (Monsanto Europe S.A.) 270-272 特弗倫大道 (Avenue de Tervuren)，B-1150 布魯塞爾 (Brussels)，比利時，登記號 C/DE/02/9。MON 863 表現 Cry3Bb1 毒素，並且對某些鞘翅目昆蟲有抗性。

5. IPC 531 棉花，來自孟山都歐洲公司，270-272 特弗倫大道，B-1150 布魯塞爾，比利時，登記號 C/ES/96/02。

6. 1507 玉米，來自先鋒海外公司 (Pioneer Overseas Corporation)，特德斯科大道 (Avenue Tedesco)，7 B-1160 布魯塞爾，比利時，登記號 C/NL/00/10。遺傳修飾的玉米，表現蛋白質 Cry1F 以獲得對某些鱗翅目昆蟲的抗性，並且表現 PAT 蛋白以獲得對除草劑草丁膦銨的耐受性。

7. NK603 x MON 810 玉米，來自孟山都歐洲公司，270-272 特弗倫大道，

B-1150 布魯塞爾，比利時，登記號 C/GB/02/M3/03。藉由將遺傳修飾的品種 NK603 和 MON 810 雜交，由常規育種的雜交玉米品種構成。NK603 × MON 810 玉米轉基因表現由土壤桿菌屬菌株 CP4 獲得的 CP4 EPSPS 蛋白質，使之耐除草劑 Roundup®（含有草甘膦），以及由蘇雲金芽孢桿菌庫爾斯塔克亞種獲得的 Cry1Ab 毒素，使之耐某些鱗翅目昆蟲，包括歐洲玉米螟。

**【0110】** 如在此使用的術語“場所”係指植物在其中或其上生長的地方，或栽培植物的種子被播種的地方，或者種子將要被置於土壤中的地方。它包括土壤、種子、以及幼苗，連同建立的植物。

**【0111】** 術語“植物”指的是植物的所有有形部分，包括種子、幼苗、幼株、根、塊莖、莖、稈、葉和果實。

**【0112】** 術語“植物繁殖材料”應當被理解為表示該植物的生殖部分，例如種子，該等部分可以用於該植物的繁殖，以及營養性材料，例如插條或塊莖（例如馬鈴薯）。可以提及，例如種子（在嚴格意義上）、根、果實、塊莖、球莖、根莖以及植物的部分。還可以提及在發芽後或破土後將被移植的發芽植物和幼小植物。該等幼小植物可以藉由浸漬進行完全或部分處理而在移植之前進行保護。較佳的是，“植物繁殖材料”應當理解為表示種子。

**【0113】** 在此提及的使用其俗名的殺有害生物劑係已知的，例如，從“殺有害生物劑手冊（The Pesticide Manual）”，15 版，英國作物保護委員會（British Crop Protection Council）2009。

**【0114】** 具有化學式 (I) 之化合物能以未修飾的形式使用，或者較佳的是，與配製物領域中常規使用的佐劑一起使用。為此目的，它們可以按

已知方式便利地配製為可乳化濃縮物、可包衣的糊劑、直接可噴霧的或可稀釋的溶液或懸浮液、稀釋乳液、可濕性粉劑、可溶性粉劑、塵劑、顆粒以及還有封裝物，例如在聚合物的物質中。對於該等組成物的類型，根據預期的目的以及盛行環境來選擇施用方法，例如噴灑、霧化、撒粉、播散、包衣或傾倒。該等組成物還可以含有另外的佐劑，如穩定劑、消泡劑、黏度調節劑、黏合劑或增黏劑，以及肥料、微量營養素供體或其他用於獲得特殊效果的配製物。

**【0115】** 適當的載體以及佐劑，例如對於農業用途，可以是固體或液體的並且係在配製物技術中有用的物質，例如天然或再生的礦物物質，溶劑、分散體、濕潤劑、增黏劑、增稠劑、黏合劑或肥料類。例如這樣的載體在 WO 97/33890 中有描述。

**【0116】** 懸浮液濃縮物係該活性化合物的高度分散的固體顆粒懸浮於其中的水性配製物。此類配製物包含抗沉降劑和分散劑，並且可以進一步包含濕潤劑，以增強活性，以及包括消泡劑和晶體生長抑制劑。在使用時，該等濃縮物稀釋在水中，並且通常作為噴霧劑施用到有待處理的區域上。活性成分的量可以範圍係該濃縮物的 0.5% 到 95%。

**【0117】** 可濕性粉劑係處於在水中或其他液態載體中容易分散的細散顆粒形式。該等顆粒包含保存在固體基質裡的活性成分。典型的固體基質包括漂白土、高嶺土、矽石和其他容易濕化的有機或無機固體。可濕性粉劑通常包含從 5% 到 95% 的活性成分加上少量的潤濕劑、分散劑或乳化劑。

**【0118】** 可乳化濃縮物係在水中或其他液體中可分散的均勻的液體組成物並且可以完全由活性化合物與液體或固體乳化劑組成，或者還可以

包含液態載體，例如二甲苯、重芳香族石腦油、異佛爾酮和其他不揮發有機溶劑。使用時，將該等可乳化濃縮物分散在水中或其他液體中並且通常以噴霧施用於待處理的區域。活性成分的量可以範圍係該濃縮物的 0.5% 到 95%。

**【0119】** 顆粒配製物包括擠出物和較粗顆粒兩者，並且通常不用稀釋地施用於需要處理的區域。用於顆粒配製物的典型載體包括沙、漂白土、凹凸棒石黏土、膨潤土、蒙脫土、蛭石、珍珠岩、碳酸鈣、磚、浮石、葉蠟石、高嶺土、白雲石、灰泥、木粉、碎玉米穗軸、碎花生殼、糖、氯化鈉、硫酸鈉、矽酸鈉、硼酸鈉、氧化鎂、雲母、氧化鐵、氧化鋅、氧化鈦、氧化銻、冰晶石、石膏、矽藻土、硫酸鈣以及其他有機或無機的吸收活性成分或被活性成分包衣的材料。顆粒配製物通常包含 5% 到 25% 的活性成分，該等成分可以包括表面活性劑，例如重芳香族石腦油、煤油和其他石油餾分、或者植物油；和/或黏著劑例如糊精、膠黏劑或合成樹脂。

**【0120】** 粉劑係活性成分與細散固體（例如滑石、黏土、麵粉以及其他有機與無機的作為分散劑和載體的固體）的可自由流動的混合物。

**【0121】** 微囊典型地為包裹在惰性多孔殼內的該活性成分的微滴或顆粒，該惰性多孔外殼允許以可控的速率讓包住的材料逃逸到環境中。包裹的微滴的直徑典型地為 1 微米到 50 微米。包裹的液體典型地構成該膠囊重量的 50% 至 95% 並且除了活性化合物外還可以包括溶劑。包裹顆粒通常是多孔顆粒，其中多孔膜將該等顆粒孔口密封，從而將該等活性種類以液體形式保存在該等顆粒孔內部。顆粒典型地是從 1 毫米至 1 釐米的直徑，較佳的是 1 至 2 毫米的直徑。顆粒藉由擠出、凝聚或成球形成，或者自然產

生。這類材料的實例為蛭石、燒結黏土、高嶺土、凹凸棒石黏土、鋸屑和碳顆粒。殼膜材料包括天然和合成橡膠、纖維材料、苯乙烯-丁二烯共聚物、聚丙烯腈、聚丙烯酸酯、聚酯、聚醯胺、聚脲、聚胺酯和澱粉黃原酸酯。

【0122】 用於農用化學品施用的其他有用配製物包括該等活性成分在溶劑（例如丙酮、烷基化萘、二甲苯和其他有機溶劑）中的簡單溶液，在該溶劑中該等活性成分以所希望的濃度完全溶解。也可以使用加壓的噴霧劑，其中由於低沸點分散劑溶劑載體的蒸發活性成分以細散形式分散。

【0123】 在上述配製物類型中對於配製本發明的組成物有用的合適農用佐劑和載體對於熟習該項技術者係熟知的。

【0124】 可以利用的液態載體包括例如水、甲苯、二甲苯、石腦油、作物油、丙酮、甲基乙基酮、環己酮、乙酸酐、乙腈、乙醯苯、乙酸戊酯、2-丁酮、氯苯、環己烷、環己醇、乙酸烷基酯、二丙酮醇、1,2-二氯丙烷、二乙醇胺、對-二乙基苯、二甘醇、松香酸二甘醇酯、二甘醇丁基醚、二甘醇乙醚、二甘醇甲醚、N,N-二甲基甲醯胺、二甲基亞砷、1,4-二噁吡、二丙二醇、二丙二醇甲醚、二丙二醇二苯甲酸酯、二丙二醇（diproxitol）、烷基吡咯啉酮、乙酸乙酯、2-乙基己醇、碳酸仲乙酯、1,1,1-三氯乙烷、2-庚酮、 $\alpha$ -蒎烯、d-蒎烯、乙二醇、乙二醇丁醚、乙二醇甲醚、 $\gamma$ -丁內酯、甘油、甘油二乙酸酯、甘油一乙酸酯、甘油三乙酸酯、十六烷、己二醇、乙酸異戊酯、乙酸異冰片(bornyl)酯、異辛烷、異佛爾酮、異丙苯、肉豆蔻酸異丙酯、乳酸、月桂胺、異丙叉丙酮、甲氧基丙醇、甲基異戊酮、甲基異丁基酮、月桂酸甲酯、辛酸甲酯、油酸甲酯、二氯甲烷、間二甲苯、正己烷、正辛胺、十八酸、乙酸辛胺酯、油酸、油胺、鄰二甲苯、苯酚、聚乙二醇

(PEG400)、丙酸、丙二醇、丙二醇單甲醚、對二甲苯、甲苯、磷酸三乙酯、三甘醇、二甲苯磺酸、石蠟、礦物油、三氯乙烯、全氯乙烯、乙酸乙酯、乙酸戊酯、乙酸丁酯、甲醇、乙醇、異丙醇、以及更高分子量的醇類例如戊醇、四氫糠醇、己醇、辛醇、等，乙二醇、丙二醇、甘油以及 N-甲基-2-吡咯啉酮。水通常是用以稀釋濃縮物的選用載體。

【0125】 合適的固體載體包括例如滑石、二氧化鈦、葉臘石黏土、矽石、凹凸棒石黏土、矽藻土 (kieselguhr)、白堊、矽藻土 (diatomaceous earth)、石灰石、碳酸鈣、膨潤土、漂白土、棉子殼、小麥粉、大豆粉、浮石、木粉、核桃殼粉以及木質素。

【0126】 在所述液體和固體組成物中可有利地採用廣泛的表面活性劑 (尤其是被設計為可在施用前被載體稀釋的那些)。該等試劑在使用時通常按重量計組成該配製物的從 0.1% 到 15%。它們在性質上可以是陰離子的、陽離子的、非離子的或聚合的並且可以作為乳化劑、潤濕劑、懸浮劑或以其他目的採用。典型的表面活性劑包括烷基硫酸酯，例如二乙醇銨十二烷基硫酸酯；烷芳基磺酸鹽，例如十二烷基苯磺酸鈣；烷基酚-環氧烷加成產物，例如壬基酚 C<sub>18</sub> 乙氧基化物；醇-環氧烷加成產物，例如十三烷基醇-C<sub>16</sub> 乙氧基化物；肥皂，例如硬脂酸鈉；烷基萘磺酸鹽，例如二丁基萘磺酸鈉；磺基琥珀酸鹽的二烷基酯，例如二(2-乙基己基)磺基琥珀酸鈉；山梨糖醇酯，例如山梨糖醇油酸酯；季胺類，例如氯化十二烷基三甲基銨；脂肪酸的聚乙二醇酯，例如聚乙二醇硬脂酸酯；環氧乙烷和環氧丙烷的嵌段共聚物；以及單和二烷基磷酸酯鹽。

【0127】 通常在農業組成物中使用的其他佐劑包括結晶作用抑制

劑、黏度改性劑、懸浮劑、噴霧液滴改性劑、顏料、抗氧化劑、發泡劑、防泡劑、遮光劑、相容性試劑、消泡劑、掩蔽劑、中和劑和緩沖劑、腐蝕抑制劑、染料、增味劑、鋪展劑、滲透助劑、微量營養素、柔潤劑、潤滑劑以及固著劑。

【0128】 此外，進一步地，其他殺生物的活性成分或組成物可以與本發明的組成物組合，並且用於本發明的方法中並且同時地或順序地隨著本發明的組成物施用。當同時施用時，該等另外的活性成分可以連同本發明的組成物一起配製或混合於例如噴霧罐中。該等另外的殺生物的活性成分可以是殺真菌劑、除草劑、殺昆蟲劑、殺細菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑和/或植物生長調節劑。

【0129】 此外，本發明的組成物還可以與一種或多種系統獲得性抗性誘導劑（“SAR”誘導劑）一起施用。SAR 誘導劑係已知的並且描述於例如美國專利案號 US 6,919,298，並且包括例如水楊酸鹽以及商用的 SAR 誘導劑阿拉酸式苯-S-甲基。

【0130】 具有化學式 (I) 之化合物通常以組成物的形式使用並且可同時地或與另外的化合物順序地施用於作物區域或待處理的作物。例如，該等另外的化合物可以是影響植物生長的肥料或微量營養素供體或其他製劑。它們還可以是選擇性除草劑或非選擇性除草劑，連同殺昆蟲劑、殺真菌劑、殺細菌劑、殺線蟲劑、殺軟體動物劑或幾種該等製劑的混合物，如果希望的話與配製物領域中通常使用的另外的載體、表面活性劑或促進施用的佐劑一起。

【0131】 具有化學式 (I) 之該等化合物可以按控制或保護抵抗致植

物病微生物的（殺真菌的）組成物的形式使用，該等組成物包括至少一種具有化學式 (I) 之化合物或至少一種較佳的如上所定義的個別化合物作為活性成分（處於游離形式或以農業上可用的鹽形式），並且包括至少一種上述佐劑。

**【0132】** 因此，本發明提供了如下組成物，較佳的是殺真菌組成物，其包括至少一種具有化學式 (I) 之化合物、農業上可接受的載體以及視情況佐劑。農業上可接受的載體係例如適合農業用途的載體。該等農業載體在本領域係熟知的。較佳的是，除了包括具有化學式 (I) 之化合物，所述組成物可以包括至少一種或多種殺有害生物活性化合物，例如另外的殺真菌活性成分。

**【0133】** 具有化學式 (I) 之化合物可以是組成物的唯一活性成分，或者適當時它可以與一種或多種另外的活性成分（例如殺有害生物劑、殺真菌劑、增效劑、除草劑或植物生長調節劑）混合。在一些情況下，另外的活性成分會導致出人意料的協同活性。

**【0134】** 適當的另外的活性成分的實例包括以下項：1,2,4-噁二唑、2,6-二硝基苯胺、醯基丙胺酸、脂族含氮化合物、脘、胺基嘧啶醇、苯胺、苯胺-嘧啶類、蔥醌類、抗生素、芳基-苯基酮、苯甲醯胺、苯-磺醯胺、苯并咪唑、苯并噁唑、苯并硫代二唑（benzothiodiazole）、苯并噁吩、苯并吡啶、苯并噁二唑（benzthiadiazole）、苄基胺基甲酸酯、丁胺、胺基甲酸酯、甲醯胺、環丙醯菌胺（carpropamid）、氯腈（chloronitrile）、肉桂酸醯胺、含銅化合物、氰基乙醯胺、氰基丙烯酸酯、氰基咪唑、氰基亞甲基-四氫噁唑、二腈（dicarbonitrile）、二羧醯胺、二甲醯亞胺、二甲基胺基磺酸鹽、二硝基

苯酚碳酸鹽、二硝基苯酚、二硝基苯基巴豆酸酯、二苯基磷酸酯、二噻烯  
 化合物、二硫代胺基甲酸酯、二硫醚、二硫戊環、乙基-胺基-噻唑甲醯胺、  
 乙基-膦酸酯、呋喃甲醯胺、吡喃葡萄糖基、葡萄糖醛酸基、戊二腈、胍、  
 除草劑/植物生長調節劑、己吡喃糖基抗生素、羥基(2-胺基)嘧啶、羥基苯胺、  
 羥基異噁唑、咪唑、咪唑啉酮、殺昆蟲劑/植物生長調節劑、異苯并呋喃酮、  
 異噁唑啉基-吡啶、異噁唑啉、馬來醯亞胺、扁桃酸醯胺、果膠衍生物、味  
 啉、去甲味啉、N-苯基胺基甲酸酯、有機錫化合物、氧硫雜環己烷甲醯胺、  
 噁唑、噁唑啉二酮、苯酚、苯氧基喹啉、苯基-乙醯胺、苯基醯胺、苯基苯  
 甲醯胺、苯基-側氧基-乙基-噻吩醯胺、苯基吡咯、苯基脲、硫代磷酸酯、  
 磷酸、鄰苯二甲酸、鄰苯二甲醯亞胺、吡啶醯胺、哌啶、哌啶、植物提取  
 物、多氧黴素、丙醯胺、鄰苯二甲醯亞胺、吡唑-4-甲醯胺、吡唑啉酮、嗒  
 吡啶酮、吡啶、吡啶甲醯胺、吡啶基-乙基苯甲醯胺、嘧啶胺、嘧啶、嘧啶-  
 胺、嘧啶酮-脞、吡咯啉、吡咯喹啉、噻唑啉酮、噻啉、噻啉衍生物、噻啉  
 -7-甲酸、噻噁啉、螺縮酮胺、嗜毬果傘素、胺磺醯三唑、磺醯胺、四唑脲、  
 噻二吡、噻二唑甲醯胺、噻唑羧醯胺、硫氰酸酯、噻吩羧醯胺、甲苯醯胺、  
 三唑苯并噻唑、三唑、三唑-硫酮、三唑-嘧啶胺、纈胺醯胺胺基甲酸酯、甲  
 基膦酸銨、含砷化合物、苯并咪唑基胺基甲酸酯、羰腈、羧醯苯胺、甲醯  
 胺醯胺、羧基苯醯胺、二苯基吡啶、呋喃醯苯胺、胼甲醯胺、咪唑啉乙酸  
 酯、間苯二甲酸酯、異噁唑啉酮、汞鹽、有機汞化合物、有機磷酸酯、噁唑  
 啉二酮、戊基磺醯基苯、苯基苯甲醯胺、硫代膦酸酯、硫代磷酸酯、吡啶  
 甲醯胺、吡啶基糠基醚、吡啶基甲基醚、SDHI、噻二吡硫酮、四氫噻唑。

【0135】 本發明的另一方面涉及控制或防止植物（例如有用植物（例

如作物))、它們的繁殖材料(例如種子)、收穫的作物(例如收穫的糧食作物)、或非生命材料免於被致植物病的或腐敗微生物或對人潛在有害的有機體(尤其是真菌有機體)侵染之方法,該方法包括將具有化學式(I)之化合物或較佳的如以上定義的單獨的化合物作為活性成分施用至該等植物、植物的各部分或至其場所、它們的繁殖材料、或非生命材料的任何部分。

**【0136】** 控制或防止係指將被昆蟲或致植物病的或腐敗微生物或對人潛在有害的有機體(尤其是真菌有機體)的侵染減少至這樣一個被證明改進的水平。

**【0137】** 控制或防止作物被致植物病微生物(尤其是真菌)或昆蟲侵染的較佳的方法係葉面施用,該方法包括施用具有化學式(I)之化合物、或含有至少一種所述化合物的農用化學品組成物。施用頻率和施用比率將取決於受相應的病原體或昆蟲侵染的風險。然而,具有化學式(I)之化合物還可以藉由用液體配製物浸泡該植物的場所或者藉由將處於固體形式的化合物例如以顆粒的形式(土壤施用)施用到土壤而經由土壤藉由根(內吸作用)滲透該植物。在水稻作物中,可以將此種顆粒施用到灌水的稻田中。具有化學式(I)之化合物還可以藉由用殺真菌劑的液體配製物浸漬種子或塊莖,或藉由用固體配製物對它們進行包衣而施用到種子(包衣)。

**【0138】** 一種配製物,例如包含具有化學式(I)之化合物、以及(如果希望的話)固體或液體佐劑或用於封裝具有化學式(I)之化合物的單體的組成物,可以按已知方式,典型地藉由將該化合物與增充劑(例如溶劑、固體載體以及,視情況表面活性化合物(表面活性劑))進行密切地混合和/或研磨來進行製備。

【0139】 組成物的施用方法、也就是說控制以上提及的類型的有害生物的方法，如噴霧、霧化、灑粉、塗刷、敷料、散射或傾倒，選擇該等方式以適合當時環境的既定目標；以及該等組成物用於控制以上提及的類型的有害生物的用途係本發明的其他主題。典型的濃度比係在 0.1 與 1000 ppm 之間，較佳的是在 0.1 與 500 ppm 之間的活性成分。每公頃的施用量較佳的是每公頃 1 g 到 2000 g 活性成分，更較佳的是 10 到 1000 g/ha，最較佳的是 10 到 600 g/ha。當作為種子浸泡試劑使用時，適宜的劑量係從 10 mg 至 1 g 活性物質/kg 種子。

【0140】 當本發明所述的組合用於處理種子時，比率為 0.001 至 50 g 具有化學式 (I) 之化合物/kg 種子、較佳的是從 0.01 至 10 g/kg 種子，這一般是足夠的。

【0141】 適當地，預防性（意指在疾病發展之前）或治癒性（意指疾病發展之後）施用根據本發明的包括具有化學式 (I) 之化合物的組成物。

【0142】 本發明的組成物能以任何常規形式使用，例如，具有雙包裝、乾種子處理用的粉劑 (DS)、種子處理用的乳液 (ES)、種子處理用的可流動性濃縮劑 (FS)、種子處理用的溶液 (LS)、種子處理用的水分散性粉劑 (WS)、種子處理用的膠囊懸浮劑 (CF)、種子處理用的凝膠 (GF)、乳液濃縮劑 (EC)、懸浮液濃縮物 (SC)、懸浮乳液 (SE)、膠囊懸浮劑 (CS)、水分散性粒劑 (WG)、可乳化性粒劑 (EG)、油包水型乳液 (EO)、水包油型乳液 (EW)、微乳液 (ME)、分散性油懸劑 (OD)、油懸劑 (OF)、油溶性液劑 (OL)、可溶性濃縮劑 (SL)、超低容量懸浮劑 (SU)、超低容量液劑 (UL)、母藥 (technical concentrate, TK)、可分散性濃縮劑 (DC)、可濕

性粉劑 (WP) 或與農業上可接受的佐劑組合的任何技術上可行的配製物形式。

【0143】 可以按常規方式製備這樣的組成物，例如藉由混合活性成分與適當的配製惰性劑 (稀釋劑、溶劑、填充劑及視情況其他配製成分，例如表面活性劑、殺生物劑、防凍劑、黏著劑、增稠劑及提供輔佐效果的化合物)。還可以使用意欲長期持續藥效的常規緩釋配製物。特別是，待以噴霧形式，如水可分散性濃縮物 (例如 EC、SC、DC、OD、SE、EW、EO 以及類似物)、可濕性粉劑及顆粒施用的配製物，可包含表面活性劑例如濕潤劑和分散劑及提供輔佐效果的其他化合物，例如甲醛與萘磺酸鹽、烷芳基磺酸鹽、木質素磺酸鹽、脂肪烷基硫酸鹽及乙氧基化烷基酚和乙氧基化脂肪醇的縮合產物。

【0144】 使用本發明的組合及稀釋劑，以適合的拌種配製物形式，例如具有對種子的良好黏著性的水性懸浮液或乾粉劑形式，用自身已知的方式將拌種配製物施用至種子。在本領域這樣的拌種配製物係已知的。這樣的拌種配製物可以包含封膠形式的單一活性成分或活性成分的組合，例如為緩釋膠囊或微膠囊。

【0145】 通常，配製物包括按重量計從 0.01% 至 90% 的活性成分，從 0 至 20% 的農業上可接受的表面活性劑及 10% 至 99.99% 的固體或液體配製惰性劑和一種或多種佐劑，該活性劑係由至少具有化學式 I 的化合物與組分 (B) 和 (C) 一起，以及視情況其他活性劑 (特別是殺微生物劑或防腐劑或類似物) 組成的。組成物的濃縮形式通常包含在約 2% 和 80% 之間，較佳的是在約 5% 和 70% 之間按重量計的活性劑。配製物的施用形式可以例如包含

按重量計從 0.01%至 20%，較佳的是按重量計從 0.01%至 5%的活性劑。而商用的產品將較佳的是被配製為濃縮物，該最終使用者將通常使用稀釋的配製物。

【0146】 然而較佳的是將商業產品配製為濃縮物，最終使用者通常使用稀釋的配製物。

#### 實施例

【0147】 接下來的實施例用來闡明本發明：本發明的某些化合物與已知的化合物的區別可以在於在低施用率下更大的療效，這可以由熟習該項技術者使用在實施例中概述的實驗程序，使用更低的施用率（如果必要的話）例如，50 ppm、12.5 ppm、6 ppm、3 ppm、1.5 ppm、0.8 ppm 或 0.2 ppm 來證實。

【0148】 貫穿本說明書，以攝氏度給出溫度並且“m.p.”係指熔點。LC/MS 係指液相層析-質譜，並且該裝置的說明和方法係：

#### 方法 G：

【0149】 光譜記錄在來自沃特斯公司的質譜儀（SQD、SQDII 單四極杆質譜儀）上，其裝備有電灑源（極性：正離子和負離子），毛細管電壓：3.00 kV，錐孔範圍：30 V，提取器：2.00 V，源溫度：150°C，去溶劑化溫度：350°C，錐孔氣體流量：50 l/h，去溶劑化氣體流量：650 l/h，質量範圍：100 至 900 Da）和來自沃特斯公司的 Acquity UPLC：二元泵，加熱管柱室，二極體陣列檢測器和 ELSD 檢測器。柱：沃特斯 UPLC HSS T3，1.8  $\mu$ m，30 x 2.1 mm，溫度：60°C，DAD 波長範圍（nm）：210 至 500，溶劑梯度：A = 水 + 5% MeOH + 0.05% HCOOH，B = 乙腈 + 0.05% HCOOH；梯度：1.2 min 內

10%-100% B；流量 (ml/min) 0.85

方法 H：

【0150】 光譜記錄在來自沃特斯公司的質譜儀 (SQD、SQDII 單四極杆質譜儀) 上，其裝備有電灑源 (極性：正離子和負離子)，毛細管電壓：3.00 kV，錐孔範圍：30 V，提取器：2.00 V，源溫度：150°C，去溶劑化溫度：350°C，錐孔氣體流量：50 l/h，去溶劑化氣體流量：650 l/h，質量範圍：100 至 900 Da) 和來自沃特斯公司的 Acquity UPLC：二元泵，加熱管柱室，二極體陣列檢測器和 ELSD 檢測器。柱：沃特斯 UPLC HSS T3，1.8  $\mu$ m，30 x 2.1 mm，溫度：60°C，DAD 波長範圍 (nm)：210 至 500，溶劑梯度：A = 水 + 5% MeOH + 0.05% HCOOH，B = 乙腈 + 0.05% HCOOH；梯度：2.7 min 內 10%-100% B；流量 (ml/min) 0.85

方法 W：

【0151】 光譜記錄在來自沃特斯公司的質譜儀 (SQD、SQDII 單四極杆質譜儀) (ACQUITY UPLC) 上，其裝備有電灑源 (極性：正離子或負離子)，毛細管電壓：3.0 kV，錐孔：30 V，提取器：3.00 V，源溫度：150°C，去溶劑化溫度：400°C，錐孔氣體流量：60 L/Hr，去溶劑化氣體流量：700 L/Hr，質量範圍：140 至 800 Da)，DAD 波長範圍 (nm)：210 至 400 和來自沃特斯公司的 Acquity UPLC：溶劑脫氣裝置，二元泵，加熱管柱室以及二極體陣列檢測器。柱：沃特斯 UPLC HSS T3，1.8  $\mu$ m，30 x 2.1 mm，溫度：60°C，DAD 波長範圍 (nm)：210 至 500，溶劑梯度：A = 水/甲醇 9:1，0.1% 甲酸，B = 乙腈 + 0.1% 甲酸，梯度：2.5 min 內 0-100% B；流量 (ml/min) 0.75

## 配製物實施例

可濕性粉劑	a)	b)	c)
活性成分[具有化學式 (I) 之化合物]	25%	50%	75%
木質素磺酸鈉	5%	5%	-
月桂基硫酸鈉	3%	-	5%
二異丁基萘磺酸鈉	-	6%	10%
苯酚聚乙二醇醚 (7-8 mol環氧乙烷)	-	2%	-
高度分散的矽酸	5%	10%	10%
高嶺土	62%	27%	-

將該活性成分與該等佐劑充分混合並且將混合物在適當的研磨機中充分研磨，從而獲得了可以用水稀釋而給出所希望的濃度的懸浮液的可濕性粉劑。

乾種子處理用的粉劑	a)	b)	c)
活性成分[具有化學式 (I) 之化合物]	25%	50%	75%
輕質礦物油	5%	5%	5%
高度分散的矽酸	5%	5%	-
高嶺土	65%	40%	-
滑石	-	-	20

將活性成分與佐劑充分地混合並且在合適的研磨機中充分地研磨該混合物，得到可以直接用於種子處理的粉末。

#### 可乳化濃縮物

活性成分[具有化學式 (I) 之化合物]	10%
辛酚聚乙二醇醚 (4-5 mol環氧乙烷)	3%
十二烷基苯磺酸鈣	3%
蓖麻油聚乙二醇醚 (35 mol環氧乙烷)	4%
環己酮	30%
二甲苯混合物	50%

在植物保護中可以使用的具有任何所要求的稀釋的乳液可以藉由用水稀釋從這種濃縮物中獲得。

塵劑	a)	b)	c)
活性成分[具有化學式 (I) 之化合物]	5%	6%	4%
滑石	95%	-	-
高嶺土	-	94%	-
礦物填充劑	-	-	96%

藉由將活性成分與載體混合並且將該混合物在適合的研磨機中研磨而獲得即用型塵劑。此類粉劑還可以用於種子的乾法敷料。

## 擠出機顆粒

活性成分[具有化學式 (I) 之化合物]	15%
木質素磺酸鈉	2%
羧甲基纖維素	1%
高嶺土	82%

將活性成分與該等佐劑混合並且研磨，並且將混合物用水潤濕。將混合物擠出並且然後在空氣流中乾燥。

## 包衣的顆粒

活性成分[具有化學式 (I) 之化合物]	8%
聚乙二醇（分子量200）	3%
高嶺土	89%

將該精細研磨的活性成分在混合器中均勻地施用到用聚乙二醇濕潤的高嶺土上。以此方式獲得無塵的包衣的顆粒。

## 懸浮液濃縮物

活性成分[具有化學式 (I) 之化合物]	40%
丙二醇	10%
壬基苯酚聚乙二醇醚（15 mol環氧乙烷）	6%
木質素磺酸鈉	10%
羧甲基纖維素	1%

矽油（處於在水中75%的乳液的形式）	1%
--------------------	----

水	32%
---	-----

將精細地研磨的活性成分與佐劑緊密地混合，得到懸浮液濃縮物，從該懸浮液濃縮物可以藉由用水稀釋獲得任何所希望的稀釋度的懸浮液。使用此類稀釋物，可以對活的植物連同植物繁殖材料進行處理並且對其針對微生物侵染藉由噴灑、傾倒或浸漬進行保護。

#### 種子處理用的可流動性濃縮劑

活性成分[具有化學式 (I) 之化合物]	40%
----------------------	-----

丙二醇	5%
-----	----

共聚物丁醇PO/EO	2%
------------	----

三苯乙炔酚，具有10-20莫耳EO	2%
-------------------	----

1,2-苯并異噻唑啉-3-酮（處於在水中20%的溶液形式）	0.5%
-------------------------------	------

單偶氮-顏料鈣鹽	5%
----------	----

矽油（處於在水中75%的乳液的形式）	0.2%
--------------------	------

水	45.3%
---	-------

將精細地研磨的活性成分與佐劑緊密地混合，得到懸浮液濃縮物，從該懸浮液濃縮物可以藉由用水稀釋獲得任何所希望的稀釋度的懸浮液。使用此類稀釋物，可以對活的植物連同植物繁殖材料進行處理並且對其針對微生物侵染藉由噴灑、傾倒或浸漬進行保護。

### 緩釋的膠囊懸浮劑

【0152】 將 28 份的具有化學式 (I) 之化合物的組合與 2 份的芳香族溶劑以及 7 份的甲苯二異氰酸酯/多亞甲基-聚苯基異氰酸酯-混合物 (8:1) 進行混合。將該混合物在 1.2 份的聚乙烯醇、0.05 份的消泡劑以及 51.6 份的水的混合物中進行乳化直至達到所希望的顆粒尺寸。向這個乳液中添加在 5.3 份的水中的 2.8 份的 1,6-二胺基己烷混合物。將該混合物攪拌直至聚合反應完成。

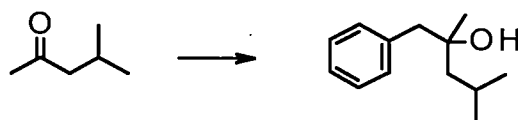
【0153】 將獲得的膠囊懸浮劑藉由添加 0.25 份的增稠劑以及 3 份的分散劑進行穩定。該膠囊懸浮劑配製物包含 28% 的活性成分。該介質膠囊的直徑係 8 微米-15 微米。

【0154】 將所得配製物作為適用於此目的的裝置中的水性懸浮液施用到種子上。

### 製備實施例

實施例 1：N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)喹啉-3-甲醯胺的製備

步驟 1：2,4-二甲基-1-苯基-戊-2-醇的製備

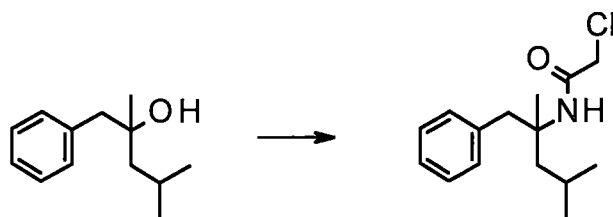


【0155】 在室溫下將 4-甲基-2-戊酮 (3.0 g, 29.4 mmol) 在二乙醚 (25 mL) 中的溶液滴加到四氫呋喃中的苄基氯化鎂 (2 M 在四氫呋喃中, 22 mL, 44 mmol) 中。然後將該反應混合物溫熱至 35°C 並在此溫度下老化 (aged) 3 h。冷卻至室溫後, 向反應中添加 HCl 水溶液 (2 M), 並將混合物在水和乙酸乙酯之間分配。將有機層用鹽水洗滌, 經 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 乾燥, 過濾並在真空

中濃縮。將該殘餘物在矽膠上藉由層析純化，以提供呈無色液體的標題化合物。

$^1\text{H}$  NMR (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.18-7.34 (m, 5H), 2.65-2.85 (m, 2H), 1.81-1.99 (m, 1H), 1.42 (dd, 2H), 1.15 (s, 3H), 0.98 (dd, 6H)。

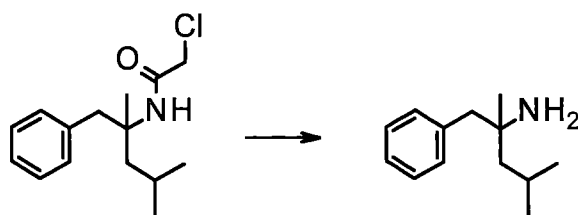
步驟 2：N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-2-氯-乙醯胺的製備



【0156】 向冷卻至 0-5°C 的 2,4-二甲基-1-苯基-戊-2-醇(3.6 g, 19 mmol) 和氯乙腈 (2.4 mL, 37 mmol) 在乙酸 (11 mL) 中的溶液中滴加濃硫酸 (3.1 mL, 56 mmol)。將得到的漿液溫熱至 20°C 並在此溫度下攪拌 3 h。然後將該反應混合物用水進行稀釋，並且用乙酸乙酯進行萃取。將有機層用  $\text{NaHCO}_3$  水溶液、鹽水洗滌，經  $\text{MgSO}_4$  乾燥，過濾並在真空中濃縮。將該殘餘物在矽膠上藉由層析純化，以提供呈無色固體的標題化合物。

$^1\text{H}$  NMR (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.20-7.34 (m, 3H), 7.08-7.16 (m, 2H), 6.13 (br. s., 1H), 3.94 (s, 2H), 3.21 (d, 1H), 2.90 (d, 1H), 1.86-1.95 (m, 1H), 1.73-1.86 (m, 1H), 1.54 (dd, 1H), 1.31 (s, 3H), 0.96 (dd, 6H)。

步驟 3：2,4-二甲基-1-苯基-戊-2-胺的製備

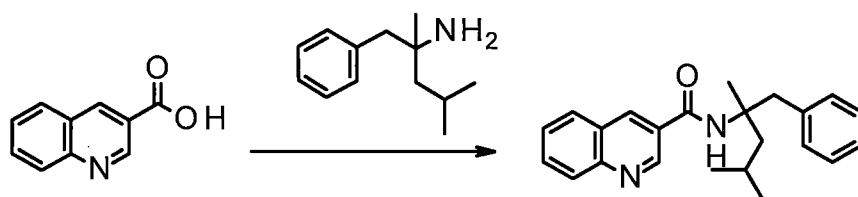


【0157】 將 N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-2-氯-乙醯胺 (3.0 g, 11.2

mmol)、乙酸 (3.9 mL, 67 mmol) 和硫脲 (1.02 g, 13.4 mmol) 在乙醇 (30 mL) 中的溶液溫熱至 80°C, 並在該溫度下攪拌 18 h。然後將反應混合物冷卻至 20°C, 用 HCl 水溶液 (0.5 M) 稀釋, 通過短矽藻土墊過濾。將濾液用乙酸乙酯洗滌; 然後將水層用 4 M 的 NaOH 鹼化並用正己烷萃取。將正己烷層用鹽水洗滌, 經 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 乾燥、過濾並真空濃縮, 以提供呈淺棕色油狀的標題化合物。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7.14-7.34 (m, 5H), 2.59-2.71 (m, 2H), 1.78-1.94 (m, 1H), 1.26-1.41 (m, 2H), 1.05 (s, 3H), 1.03 (br.s, 2H), 0.98 (dd, 6H)。

步驟 4: N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)喹啉-3-甲醯胺的製備



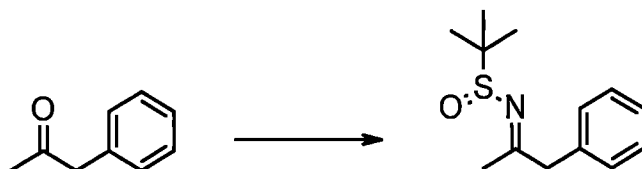
【0158】 在室溫下向喹啉-3-甲酸 (0.20 g, 1.15 mmol)、2,4-二甲基-1-苄基-戊-2-胺 (0.22 g, 1.15 mmol)、三乙胺 (0.14 g, 1.4 mmol) 和 1-羥基-7-氮雜苯并三唑 (0.16 g, 1.15 mmol) 在無水二甲基甲醯胺 (5 mL) 中的溶液中添加 N-(3-二甲基胺丙基)-N'-乙基碳二亞胺 HCl (0.22 g, 1.15 mmol) 並將所得溶液在 20°C 下老化 18 小時。添加水並將該混合物用乙酸乙酯萃取。將有機相用鹽水洗滌, 經 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 乾燥, 過濾並在真空中濃縮。將該殘餘物在矽膠上藉由層析純化, 以提供呈白色固體的標題化合物, m.p.: 121°C。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 9.12 (d, 1H), 8.40 (d, 1H), 8.13 (d, 1H), 7.86 (d, 1H), 7.74-7.82 (m, 1H), 7.56-7.64 (m, 1H), 7.16-7.30 (m, 5H), 5.73 (s, 1H), 3.46 (d, 1H), 2.98 (d, 1H), 2.17 (dd, 1H), 1.84-1.99 (m, 1H), 1.67 (dd, 1H), 1.43 (s, 3H), 1.02

(d, 6H)。

實施例 2：N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁-3-烯基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺的製備

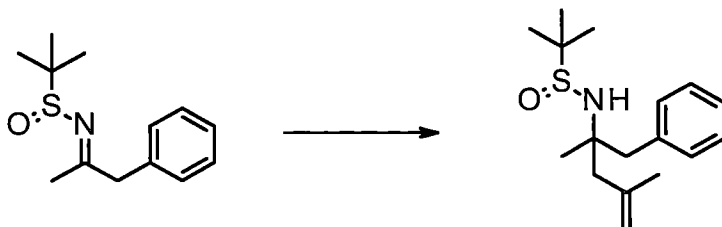
步驟 1：2-甲基-N-(1-甲基-2-苯基-亞乙基)丙烷-2-亞磺醯胺的製備



【0159】 將 1-苯基丙-2-酮 (8.30 g, 61.9 mmol) 溶於四氫呋喃 (75 mL) 中，在室溫下依次添加乙醇鈦 (IV) (32.6 g, 92.8 mmol) 和 2-甲基丙烷-2-亞磺醯胺 (7.50 g, 61.9 mmol) 並將所得混合物溫熱至 60°C。在 60°C 下攪拌 2 h 後，將反應冷卻至室溫，並用 NaHCO<sub>3</sub> 水溶液淬滅。將所得混合物過濾，並將濾餅用乙酸乙酯洗滌。將合併的濾液用乙酸乙酯萃取，將有機層用鹽水洗滌，用硫酸鈉乾燥，過濾並真空濃縮，以提供呈淺黃色油狀物的標題化合物 (純度 > 80%，順式-反式異構物的比例約為 4:1)，其原樣用於下一步驟。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>, 主要的異構物) δ 7.17-7.43 (m, 5H), 3.72 (d, 1H), 3.70 (d, 1H), 2.32 (s, 3H), 1.23 (s, 9H)。

步驟 2：N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁-3-烯基)-2-甲基-丙烷-2-亞磺醯胺的製備

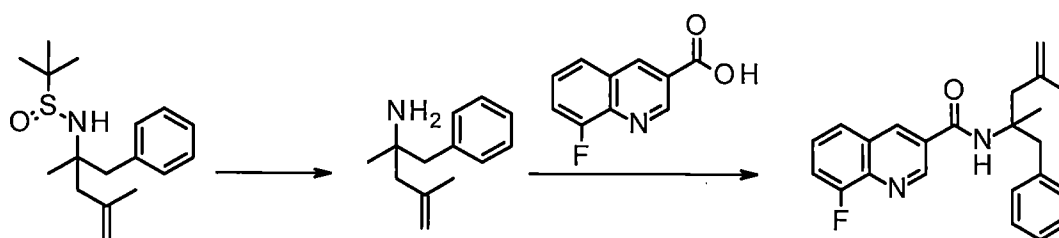


【0160】 將粗 2-甲基-N-(1-甲基-2-苯基-亞乙基)丙烷-2-亞磺醯胺 (80% 純度, 7.4 g, 24.9 mmol) 在二氯甲烷 (100 mL) 中的溶液緩慢添加到可商

購的保持在 $-50^{\circ}\text{C}$ 的2-甲基烯丙基氯化鎂在THF(0.5 M, 75 mL, 37.4 mmol)中的溶液中。將反應混合物經4小時逐漸溫熱至 $20^{\circ}\text{C}$ ，並在 $20^{\circ}\text{C}$ 下攪拌過夜。然後添加飽和 $\text{NH}_4\text{Cl}$ 溶液，用乙酸乙酯萃取混合物，並將有機層用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並真空濃縮。將該殘餘物在矽膠上藉由快速層析純化，以提供作為非鏡像異構物混合物的標題化合物。

$^1\text{H}$  NMR (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ , 主要的異構物)  $\delta$  6.94-7.18 (m, 5H), 4.82 (s, 1H), 4.71 (s, 1H), 3.39 (s, 1H), 2.76 (d, 1H), 2.55 (d, 1H), 2.21 (d, 2H), 1.63 (s, 3H), 1.06 (s, 3H), 0.94 (s, 9H)。

步驟3：N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁-3-烯基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺的製備



【0161】 向 N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁-3-烯基)-2-甲基-丙烷-2-亞磺醯胺 (5.2 g, 15.9 mmol) 在甲醇 (16 mL) 中的冰冷的溶液中添加 HCl 在 1,4-二噁吡 (4 M, 6 mL, 24 mmol) 中的溶液，並將所得溶液在  $0-5^{\circ}\text{C}$  下攪拌 2 h。然後真空中除去所有揮發物，以提供棕色膠狀殘餘物，將該殘餘物用乙醚/庚烷的混合物研磨。將所得淡棕色固體真空乾燥並直接用於下一步驟。

【0162】 將部分上述獲得的固體鹽酸鹽 (2 g, 8.0 mmol) 懸浮於二氯甲烷 (40 mL) 中，並在環境溫度下依次添加 8-氟喹啉-3-甲酸 (1.68 g, 8.8 mmol)、三乙胺 (2.8 mL, 19.9 mmol)、1-羥基-7-氮雜苯并三唑 (1.2 g, 8.8 mmol) 和 N-(3-二甲基胺基丙基)-N'-乙基碳二亞胺-HCl (1.72 g, 8.8 mmol)。將所得混合物在  $20^{\circ}\text{C}$  下老化 2 h。然後添加水並將該混合物用二氯甲烷萃取。將

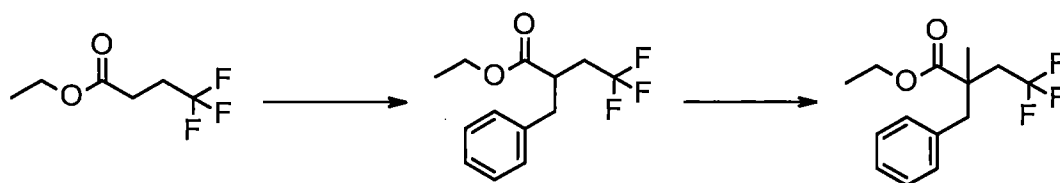
有機層用鹽水洗滌，經硫酸鈉乾燥，過濾並在真空中濃縮。將該殘餘物在矽膠上藉由快速層析純化，以提供呈白色固體的標題化合物，m.p. : 115°C-117°C。

$^1\text{H}$  NMR (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  9.11-9.26 (m, 1H), 8.50 (s, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.45-7.64 (m, 2H), 7.19-7.37 (m, 5H), 5.96 (s, 1H), 5.01 (s, 1H), 4.84 (s, 1H), 3.57 (d, 1H), 3.08 (dd, 2H), 2.46 (d, 1H), 1.89 (s, 3H), 1.47 (s, 3H)。

$^{19}\text{F}$  NMR (377 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  -124.64 (s)。

實施例 3：N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺

步驟 1：2-苄基-4,4,4-三氟-2-甲基-丁酸乙酯的製備



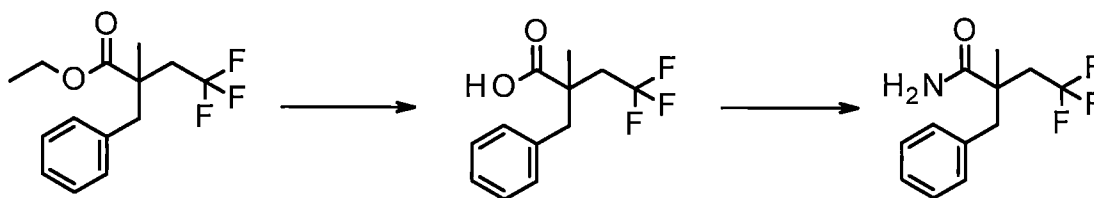
【0163】 在-70°C 下將正丁基鋰(2.5 M 在己烷中, 100 mL, 248.9 mmol) 緩慢添加到二異丙基胺 (35.2 mL, 248.9 mmol) 在四氫呋喃 (400 mL) 中的溶液中。將所得溶液在-70°C 下老化 30 min, 並且然後滴加 4,4,4-三氟丁酸乙酯 (36 g, 207.4 mmol)。將反應在-70°C 下攪拌 2 h, 添加苄基溴 (43.2 g, 248.9 mmol), 並將反應混合物逐漸溫熱至室溫, 歷時約 2 h。添加飽和  $\text{NH}_4\text{Cl}$  溶液, 並用甲基三級丁基醚萃取混合物。將有機層用水、鹽水洗滌, 經  $\text{MgSO}_4$  乾燥, 過濾並在真空中濃縮。使殘餘的油通過矽膠短墊, 將該墊用環己烷: 乙酸乙酯 (2 : 1) 沖洗, 並將濾液真空濃縮, 得到呈淺橙色油狀物的 4,4,4-三氟-2-甲基-丁酸乙酯。

【0164】 在-70°C 下將正丁基鋰(2.5 M 在己烷中, 99 mL, 247.2 mmol)

緩慢添加到二異丙基胺 (35 mL, 247.2 mmol) 在四氫呋喃 (380 mL) 中的溶液中。將所得溶液在  $-70^{\circ}\text{C}$  下老化 30 分鐘，並且然後在  $-70^{\circ}\text{C}$  下緩慢添加上面得到的粗產物 (49.5 g, 190.2 mmol, 用四氫呋喃 (30 mL) 稀釋)。將所得深色溶液在  $-70^{\circ}\text{C}$  下攪拌 2 h, 然後添加甲基碘 (13.1 mL, 209.3 mmol)。將反應混合物逐漸溫熱至  $20^{\circ}\text{C}$ , 歷時約 3 h, 然後用飽和  $\text{NH}_4\text{Cl}$  溶液淬滅, 並用甲基三級丁基醚萃取。將有機層用水、鹽水洗滌, 經  $\text{MgSO}_4$  乾燥, 過濾並在真空中濃縮。使殘餘的油通過矽膠短墊, 將該墊用環己烷:乙酸乙酯 (2:1) 沖洗, 並將濾液真空濃縮, 提供淺棕色油狀的標題化合物 (約 80% 純)。

$^1\text{H NMR}$  (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.05-7.33 (m, 5H), 4.13 (q, 2H), 2.98 (d, 1H), 2.81-2.72 (m, 2H), 2.11-2.32 (m, 1H), 1.28 (s, 3H), 1.21 (t, 3H)。

步驟 2: 2-苄基-4,4,4-三氟-2-甲基-丁醯胺的製備

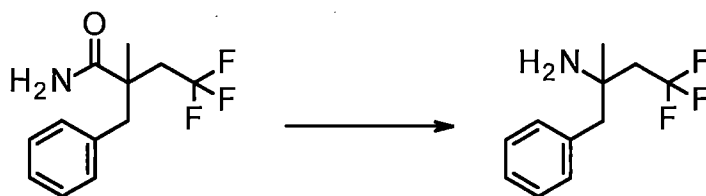


**【0165】** 在室溫下將 2-苄基-4,4,4-三氟-2-甲基-丁酸乙酯 (25.5 g, 93.0 mmol) 在 1,4-二噁啉 (45 mL) / 乙醇 (45 mL) 中的溶液用  $\text{NaOH}$  (7.6 g, 186 mmol) 處理, 將所得溶液溫熱至  $90^{\circ}\text{C}$  並在  $90^{\circ}\text{C}$  下老化 1 h。冷卻至室溫後, 將反應混合物濃縮至原體積的約 50%。將殘餘物用水稀釋並用環己烷洗滌。然後在冰冷卻、溫度  $< 25^{\circ}\text{C}$  下用  $\text{HCl}$  (濃) 酸化該水層, 並用  $\text{DCM}$  萃取混合物。將該有機層用鹽水洗滌, 用  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  乾燥, 過濾並真空濃縮, 得到呈深黃色油狀物的 2-苄基-4,4,4-三氟-2-甲基-丁酸。

【0166】 在 20°C，向粗 2-苄基-4,4,4-三氟-2-甲基-丁酸（6.7 g，27.2 mmol）和二甲基甲醯胺（0.1 mL，1.4 mmol）在二氯甲烷（25 mL）中的溶液中緩慢添加草醯氯（2.5 mL，28.6 mmol）。將所得溶液在 20°C 下攪拌 1 h，並且然後真空除去所有揮發物。將殘餘物溶於二氯甲烷（25 mL）中，並將所得溶液緩慢添加到冰冷卻的快速攪拌的氨水溶液（25 wt%，21 mL）中。將所得混合物逐漸溫熱至室溫並攪拌 30 min。然後添加水，並將混合物用二氯甲烷萃取。將有機層用水、鹽水洗滌，用 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 乾燥、過濾並真空濃縮，以提供呈淺棕色油狀的標題化合物。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7.13-7.44 (m, 5H), 5.42 (br s, 2H), 3.13 (d, 1H), 2.97-3.09 (m, 1H), 2.67 (d, 1H), 2.18 (qd, 1H), 1.33 (s, 3H)。

步驟 3：4,4,4-三氟-2-甲基-1-苄基-丁-2-胺的製備

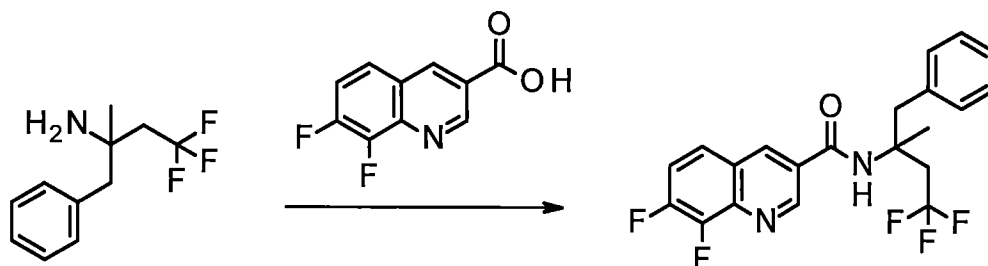


【0167】 在室溫下向 2-苄基-4,4,4-三氟-2-甲基-丁醯胺（6.6 g，26.9 mmol）在乙腈（25 mL）/水（25 mL）中的溶液中添加二乙醯氧基碘苯（9.73 g，29.6 mmol）和三氟乙酸（4.6 mL，59.2 mmol）並將所得混合物在室溫下攪拌 18 h。然後真空除去乙腈，用濃 HCl 將剩餘的水性乳液調節至 pH 1，並用甲基三級丁基醚洗滌。將水層用 NaOH（8 M）鹼化至 pH 12，並用甲基三級丁基醚萃取。將有機層用鹽水洗滌，經 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 乾燥、過濾並真空濃縮，以提供呈黃色油狀的標題化合物。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 7.16-7.50 (m, 5H), 2.81 (s, 2H), 2.13-2.41 (m,

2H), 1.28 (s, 3H)。

步驟 4：N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺的製備



【0168】 在室溫下向 7,8-二氟喹啉-3-甲酸 (0.35 g, 1.67 mmol)、4,4,4-三氟-2-甲基-1-苄基-丁-2-胺 (0.40 g, 0.84 mmol)、三乙胺 (0.6 mL, 4.2 mmol) 和 1-羥基-7-氮雜苯并三唑 (0.27 g, 2.0 mmol) 在二氯甲烷 (10 mL) 中的溶液中添加 N-(3-二甲基氨基丙基)-N'-乙基碳二亞胺-HCl (0.39 g, 2.0 mmol)。在室溫下攪拌所得混合物 15 小時，並且然後用水淬滅。將混合物用二氯甲烷萃取，將有機層用水、鹽水洗滌，經 Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 乾燥，過濾並真空濃縮。將該殘餘物在矽膠上藉由快速層析純化，以提供呈白色固體的標題化合物，m.p. : 158°C-160°C。

<sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 9.07 (d, 1H), 8.38 (t, 1H), 7.62 (ddd, 1H), 7.47 (dt, 1H), 7.11-7.38 (m, 5H), 6.14 (s, 1H), 3.62 (d, 1H), 3.46 (dd, 1H), 2.96 (d, 1H), 2.58 (qd, 1H), 1.50 (s, 3H)。

<sup>19</sup>F NMR (377 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ -59.75 (s, 1F), -132.03 (d, 1F), -150.23 (d, 1F)。

實施例 4：以下單一異構物的製備：

N-[(1*S*)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺和

N-[(1*R*)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺

【0169】 藉由製備型 HPLC 層析法使用下文概述的條件對外消旋 N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺混合物進行手性拆分。

分析型 HPLC 方法

SFC：沃特斯 Acquity UPC<sup>2</sup>/QDa

PDA 檢測器沃特斯 Acquity UPC<sup>2</sup>

柱：大賽璐 (Daicel) SFC CHIRALPAK® OZ，3  $\mu$ m，0.3 cm x 10 cm，

40°C 流動相：A：CO<sub>2</sub> B：iPr 梯度：10% B 在 2.8 min 內

ABPR：1800 psi

流速：2.0 ml/min

檢測：233 nm

樣品濃度：1 mg/mL 在 ACN/iPr 50/50 中

注射：1  $\mu$ L

製備型 HPLC 方法：

來自沃特斯 (Waters) 的自動純化系統：2767 樣品管理器，2489 紫外/可見檢測器，2545 四元梯度模組。

柱：大賽璐 CHIRALPAK® IF，5  $\mu$ m，1.0 cm x 25 cm

流動相：TBME/EtOH 98/02

流速：10 ml/min 檢測：UV 265 nm

樣品濃度：165 mg/mL 在 EE/ACN 中

注射：30-90  $\mu$ l，5-15 mg

結果：

第一洗脫鏡像異構物	第二洗脫鏡像異構物
保留時間 (min) 約1.05	保留時間 (min) 約1.51
化學純度 (在220 nm處的面積%) 99	化學純度 (在220 nm處的面積%) 99
鏡像異構物過量 (%) > 99	鏡像異構物過量 (%) > 99

洗脫時間為 1.05 分鐘的化合物係 N-[(1*R*)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺，對應於化合物 F-38。

洗脫時間為 1.51 分鐘的化合物係 N-[(1*S*)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺，對應於化合物 F-37。

實施例 5：以下單一異構物的製備：

N-[(1*S*)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺

N-[(1*R*)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺

**【0170】** 藉由製備型 HPLC 層析法使用下文概述的條件對外消旋 N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺混合物進行手性拆分。

分析型 HPLC 方法

SFC：沃特斯 Acquity UPC<sup>2</sup>/QDa

PDA 檢測器沃特斯 Acquity UPC<sup>2</sup>

柱：大賽璐 SFC CHIRALPAK® ID，3 μm，0.3 cm x 10 cm，40°C

流動相：A：CO<sub>2</sub> B：iPr 梯度：15% B 在 2.8 min 內

ABPR：1800 psi

流速：2.0 ml/min

檢測：235 nm

樣品濃度：1 mg/mL 在 ACN/iPr 50/50 中

注射：1  $\mu$ L

製備型 HPLC 方法：

來自沃特斯 (Waters) 的自動純化系統：2767 樣品管理器，2489 紫外/可見檢測器，2545 四元梯度模組。

柱：大賽璐 CHIRALPAK® IF，5  $\mu$ m，1.0 cm x 25cm

流動相：Hept/EtOH 95/05

流速：10 ml/min

檢測：UV 265 nm

樣品濃度：10 mg/mL 在 MeOH/DCM (1/1) 中

注射：500  $\mu$ l

結果：

第一洗脫鏡像異構物	第二洗脫鏡像異構物
保留時間 (min) 約 1.49	保留時間 (min) 約 1.88
化學純度 (在 235 nm 處的面積 %) 99	化學純度 (在 235 nm 處的面積 %) 99
鏡像異構物過量 (%) > 99	鏡像異構物過量 (%) > 99

洗脫時間為 1.49 分鐘的化合物係 N-[(1*S*)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺，對應於化合物 F-11。

洗脫時間為 1.88 分鐘的化合物係 N-[(1*R*)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺，對應於化合物 F-12。

實施例 6：以下單一異構物的製備：

N-[(1*R*)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺和

N-[(1S)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺

【0171】 藉由製備型 HPLC 層析法使用下文概述的條件對外消旋 N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺混合物進行手性拆分。

分析型 HPLC 方法：

SFC：沃特斯 Acquity UPC<sup>2</sup>/QDa

PDA 檢測器沃特斯 Acquity UPC<sup>2</sup>

柱：大賽璐 SFC CHIRALPAK® IA，3 μm，0.3 cm x 10 cm，40°C

流動相：A：CO<sub>2</sub> B：MeOH 梯度：25% B 在 1.8 min 內

ABPR：1800 psi

流速：2.0 ml/min

檢測：240 nm

樣品濃度：1 mg/mL 在 Hept/EtOH 90/10 中

注射：3 μL

製備型 HPLC 方法：

來自沃特斯（Waters）的自動純化系統：2767 樣品管理器，2489 紫外/可見檢測器，2545 四元梯度模組。

柱：大賽璐 CHIRALPAK® IE，5 μm，1.0 cm x 25 cm

流動相：Hept/EtOH 90/10

流速：10 ml/min

檢測：UV 265 nm

樣品濃度：100 mg/mL 在 MeOH/DCM（1/3）（經過濾）中

注射：150 μl-250 μl

第一洗脫鏡像異構物	第二洗脫鏡像異構物
保留時間 (min) 約0.97	保留時間 (min) 約1.32
化學純度 (在240 nm處的面積%) 99	化學純度 (在240 nm處的面積%) 99
鏡像異構物過量 (%) > 99	鏡像異構物過量 (%) > 99

洗脫時間為 0.97 分鐘的化合物係 N-[(1*S*)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺，對應於化合物 F-1。

洗脫時間為 1.88 分鐘的化合物係 N-[(1*R*)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺，對應於化合物 F-2。

實施例 7：以下單一異構物的製備：

N-[(1*R*)-1-苄基-3-氟-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺和

N-[(1*S*)-1-苄基-3-氟-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺

**【0172】** 藉由製備型 HPLC 層析法使用下文概述的條件對外消旋 N-(1-苄基-3-氟-1,3-二甲基-丁基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺混合物進行手性拆分。

分析型 HPLC 方法：

SFC：沃特斯 Acquity UPC<sup>2</sup>/QDa

PDA 檢測器沃特斯 Acquity UPC<sup>2</sup>

柱：大賽璐 SFC CHIRALPAK® IA，3 μm，0.3 cm x 10 cm，40°C

流動相：A：CO<sub>2</sub> B：MeOH 梯度：30% B 在 1.8 min 內

ABPR：1800 psi

流速：2.0 ml/min

檢測：230 nm

樣品濃度：1 mg/mL 在 ACN/iPr 50/50 中

注射：1  $\mu$ L 製備型 HPLC 方法：

來自沃特斯 (Waters) 的自動純化系統：2767 樣品管理器，2489 紫外/可見檢測器，2545 四元梯度模組。

柱：大賽璐 CHIRALPAK® IA，5  $\mu$ m，1.0 cm x 25 cm

流動相：Hept/EtOH 90/10

流速：10 ml/min

檢測：UV 265 nm

樣品濃度：127 mg/mL 在 EE 中

注射：40-160  $\mu$ l，5-20 mg

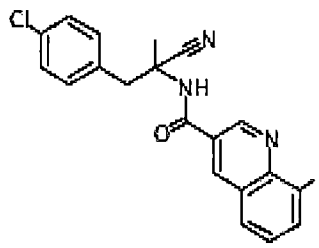
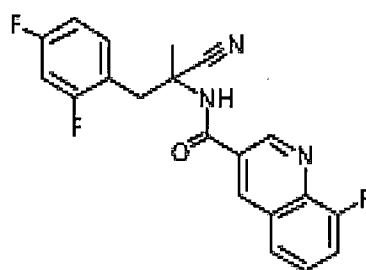
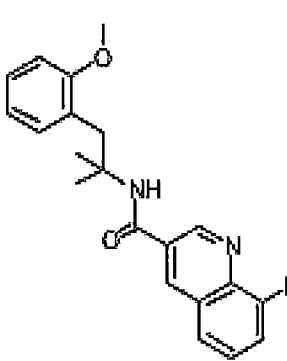
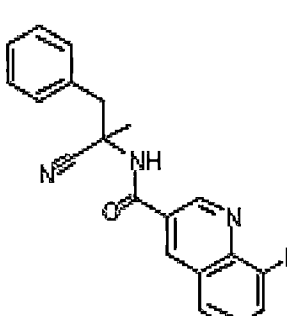
第一洗脫鏡像異構物	第二洗脫鏡像異構物
保留時間 (min) 約0.88	保留時間 (min) 約1.51
化學純度 (在235 nm處的面積%) 99	化學純度 (在235 nm處的面積%) 99
鏡像異構物過量 (%) > 99	鏡像異構物過量 (%) > 99

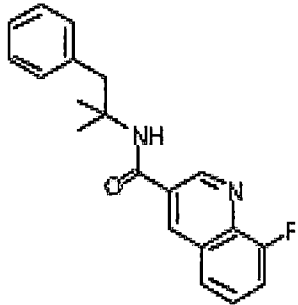
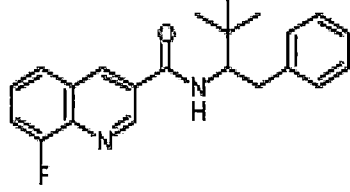
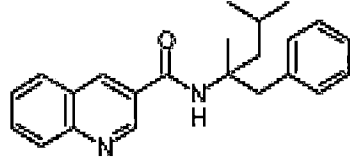
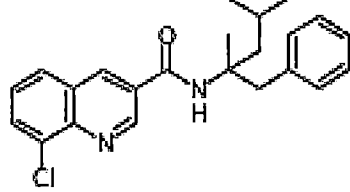
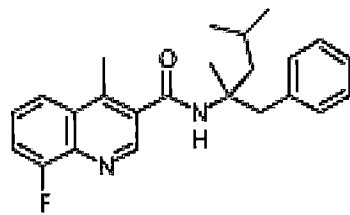
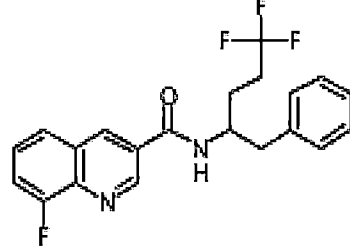
洗脫時間為 0.88 分鐘的化合物係 N-[(1*R*)-1-苄基-3-氟-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺，對應於化合物 F-23。

洗脫時間為 1.51 分鐘的化合物係 N-[(1*S*)-1-苄基-3-氟-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺，對應於化合物 F-24。

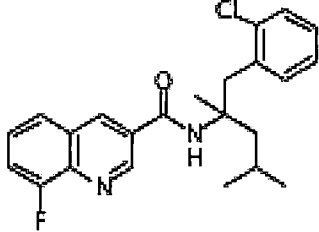
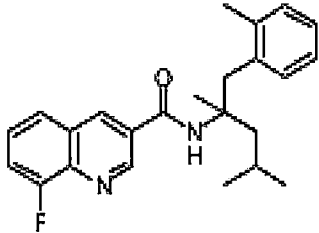
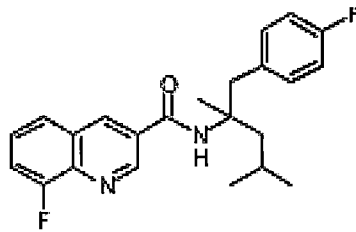
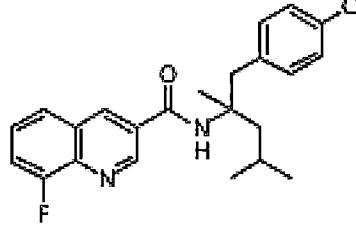
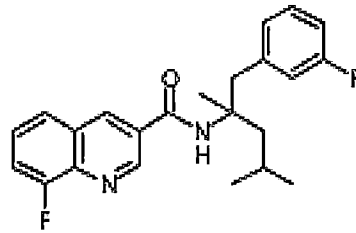
表 E：具有化學式 (I) 之化合物的物理數據

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-1	N-[2-(2- 氟 苯基)-1,1,2- 三甲基-丙 基]喹啉-3- 甲醯胺		1.08	351	G	
E-2	N-[2-(2- 氟 苯基)-1,1- 二甲基-乙 基]喹啉-3- 甲醯胺		1.00	323	G	
E-3	N-[1,1-二甲 基-2-[2-(三 氟甲氧基) 苯基]乙基] 喹啉-3-甲醯 胺		1.79	389	G	145 - 149
E-4	N-[1- 氰基 -2-(2- 氟 苯 基)-1-甲基- 乙基]喹啉 -3-甲醯胺		1.35	334	G	134 - 139
E-5	N-(1- 苄基 -1,2-二甲基 -丙基)-8-氟- 喹啉-3-甲醯 胺		1.12	351	G	
E-6	N-(1- 苄基 -1,3-二甲基 -丁基)-8-氟- 喹啉-3-甲醯 胺		1.17	365	H	110 - 112

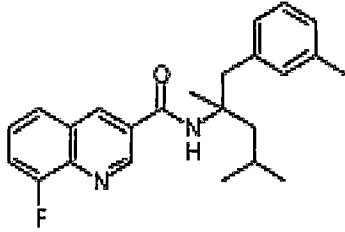
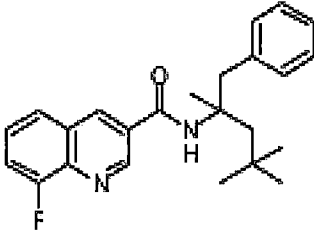
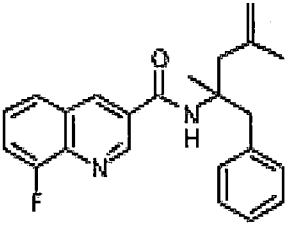
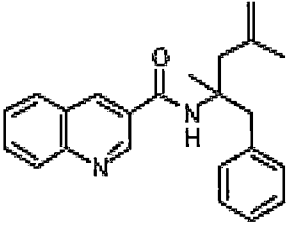
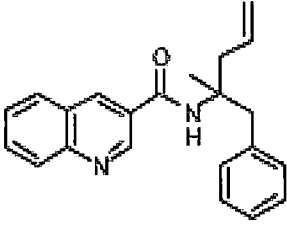
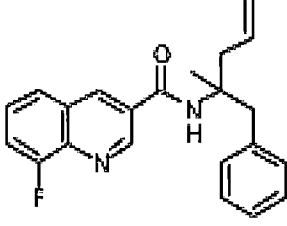
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-7	N-[2-(4-氯 苯基)-1-氰 基-1-甲基- 乙基]-8-氟- 喹啉-3-甲醯 胺		1.51	368	W	
E-8	N-[1-氰基 -2-(2,4-二氟 苯基)-1-甲 基-乙基]-8- 氟-喹啉-3- 甲醯胺		1.43	370	W	
E-9	8-氟 -N-[2-(2-甲 氧基苯基)-1,1-二 甲基-乙基] 喹啉-3-甲醯 胺		1.64	353	W	
E-10	N-(1-氰基 -1-甲基-2- 苯基-乙基)-8- 氟-喹啉-3-甲 醯胺		1.37	334	W	

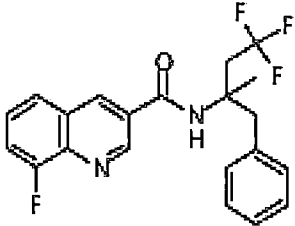
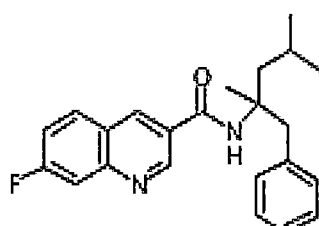
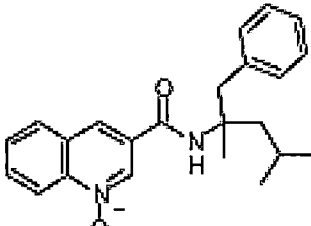
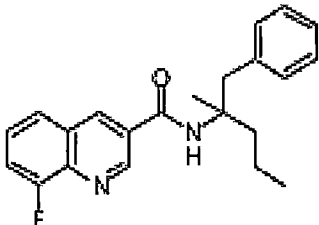
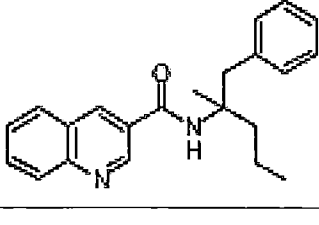
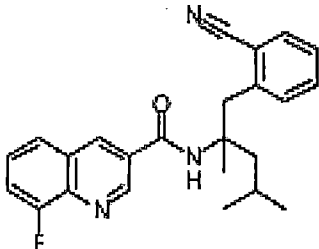
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-11	N-(1,1-二甲基-2-苯基-乙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.56	323	W	
E-12	N-(1-苄基-2,2-二甲基-丙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.03	351	H	163 - 164
E-13	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)喹啉-3-甲醯胺		1.13	347	H	
E-14	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-8-氯-喹啉-3-甲醯胺		1.19	381	H	147 - 148
E-15	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-8-氟-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.14	379	H	92 - 94
E-16	N-(1-苄基-4,4,4-三氟-丁基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.64	391	H	157 - 161

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-17	N-(1-苄基-4,4,4-三氟-丁基)-8-氯-喹啉-3-甲醯胺		1.75	407	H	163 - 167
E-18	N-[2-(2-氯苯基)-1-氰基-1-甲基-乙基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		0.96	368-370	G	198 - 203
E-19	N-(1-苄基-4,4,4-三氟-丁基)-8-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.79	387	H	158 - 161
E-20	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-8-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.24	361	H	132 - 133
E-21	8-氟-N-[1-[(2-氟苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲醯胺		1.16	383	G	105 - 106

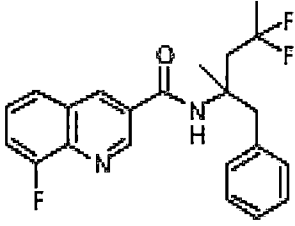
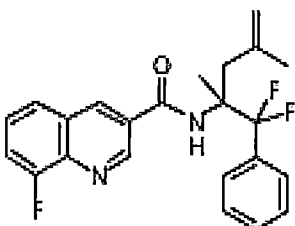
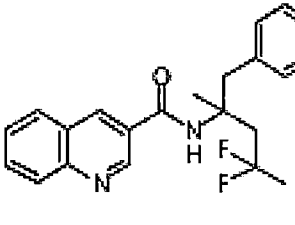
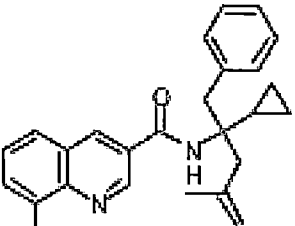
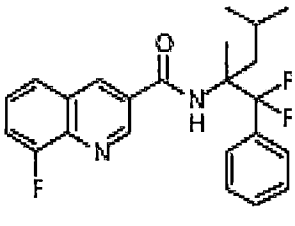
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-22	N-[1-[(2- 氯 苯 基 ) 甲 基 ]-1,3- 二 甲 基 - 丁 基]-8- 氟- 喹 啉-3-甲 醯 胺		1.21	399-40 1	G	109 - 110
E-23	N-[1,3- 二 甲 基 -1-( 鄰 甲 苯 基 甲 基 ) 丁 基]-8- 氟- 喹 啉-3-甲 醯 胺		1.19	379	G	125 - 126
E-24	8- 氟 -N-[1-[(4- 氟 苯 基 ) 甲 基 ]-1,3- 二 甲 基 - 丁 基] 喹 啉-3-甲 醯 胺		1.15	383	G	38 - 39
E-25	N-[1-[(4- 氯 苯 基 ) 甲 基 ]-1,3- 二 甲 基 - 丁 基]-8- 氟- 喹 啉-3-甲 醯 胺		1.21	399-40 1	G	57 - 59
E-26	8- 氟 -N-[1-[(3- 氟 苯 基 ) 甲 基 ]-1,3- 二 甲 基 - 丁 基] 喹 啉-3-甲 醯 胺		1.15	383	G	45 - 47

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-27	N-[1-[(3-氯苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.20	399-401	G	41 - 42
E-28	N-(1-苄基-3,3-二甲基-丁基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.10	365	G	178 - 180
E-29	N-(1-苄基-3-甲基-丁基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.07	351	G	136-139
E-30	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-丙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		0.98	377	G	140 - 142
E-31	N-[1,3-二甲基-1-(對甲苯基甲基)丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.21	379	G	116 - 118
E-32	N-[1-[(4-氰基苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹		1.10	390	G	67 - 69

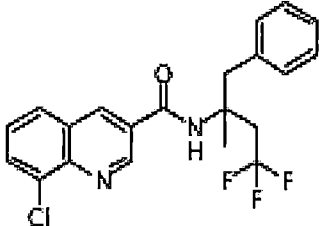
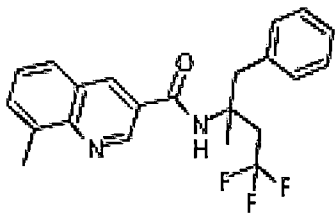
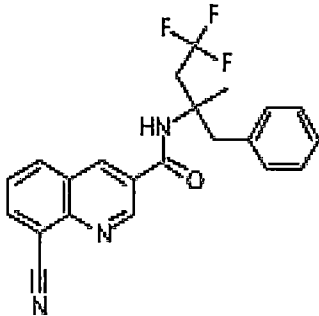
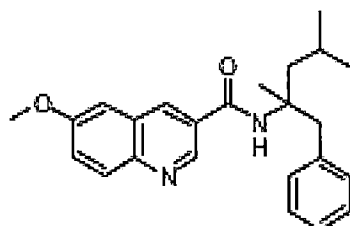
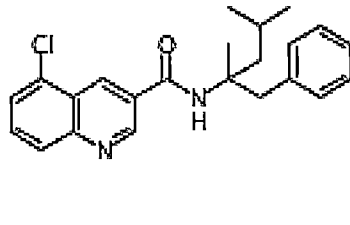
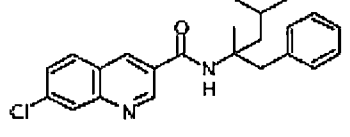
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
	喹啉-3-甲醯胺					
E-33	N-[1,3-二甲基-1-(間甲苯基甲基)丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.20	379	G	94 - 96
E-34	N-(1-苄基-1,3,3-三甲基-丁基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.19	379	G	48 - 50
E-35	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁-3-烯基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.12	363	G	115 - 117
E-36	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁-3-烯基)喹啉-3-甲醯胺		1.11	345	G	99 - 103
E-37	N-(1-苄基-1-甲基-丁-3-烯基)喹啉-3-甲醯胺		1.07	331	G	
E-38	N-(1-苄基-1-甲基-丁-3-烯基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.08	349	G	

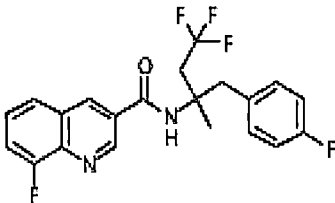
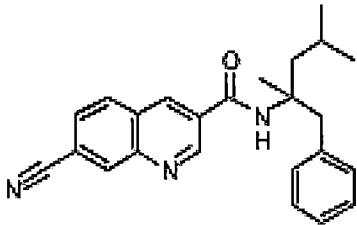
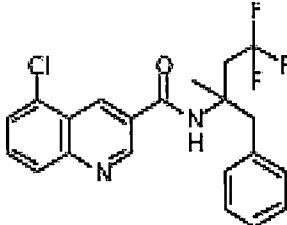
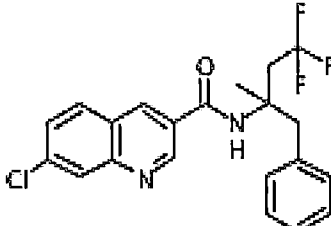
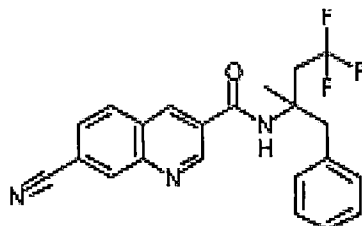
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-39	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.06	391	G	158 - 160
E-40	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-7-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.15	365	G	142 - 144
E-41	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-1-側氧基-喹啉-1-鎊-3-甲醯胺		1.06	363	G	
E-42	N-(1-苄基-1-甲基-丁基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.12	351	G	
E-43	N-(1-苄基-1-甲基-丁基)喹啉-3-甲醯胺		1.10	333	G	
E-44	N-[1-[(2-氰基苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.10	390	G	43 - 44

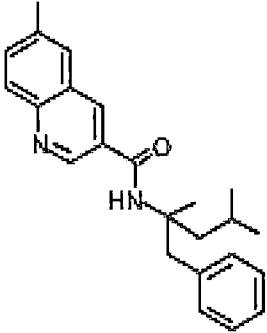
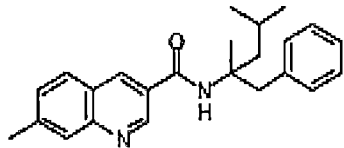
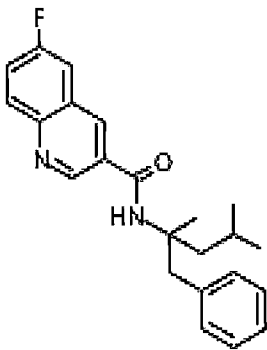
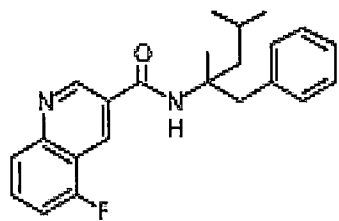
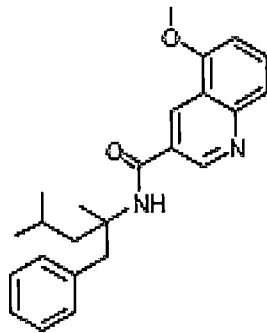
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-45	N-[1-[(3-溴苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.22	443-445	G	87 - 89
E-46	N-[1-[(3-氰基苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.10	390	G	45 - 46
E-47	N-[1-苄基-1-甲基-2-(1-甲基環丙基)乙基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.16	377	G	126 - 129
E-48	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺		1.19	383	G	114 - 116
E-49	N-(1-苄基-2-環丙基-1-甲基-乙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.11	363	G	

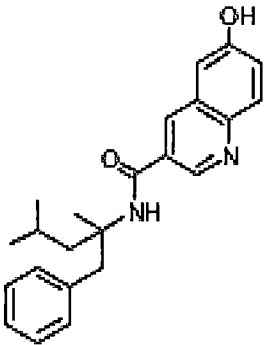
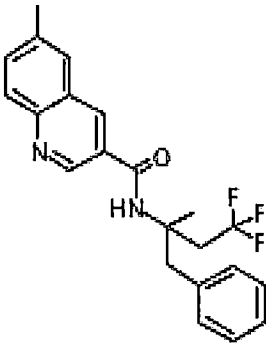
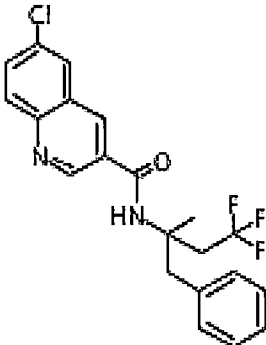
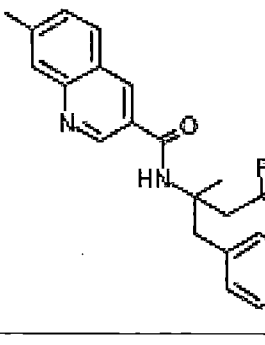
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-50	N-(1-苄基-3,3-二氟-1-甲基-丁基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.06	387	G	
E-51	N-[1-[二氟(苄基)甲基]-1,3-二甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.11	399	G	
E-52	N-(1-苄基-3,3-二氟-1-甲基-丁基)喹啉-3-甲醯胺		1.05	369	G	131 - 133
E-53	N-(1-苄基-1-環丙基-3-甲基-丁-3-烯基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		2.01	389	H	
E-54	N-[1-[二氟(苄基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.15	401	G	

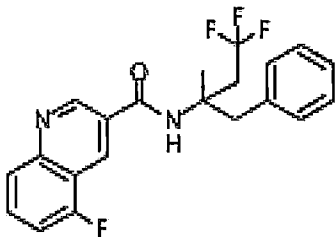
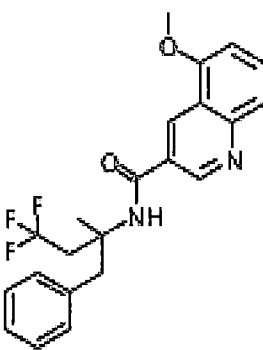
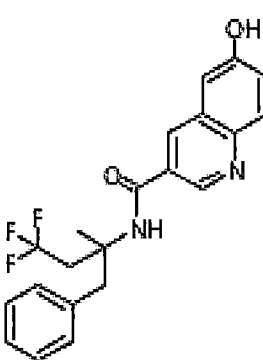
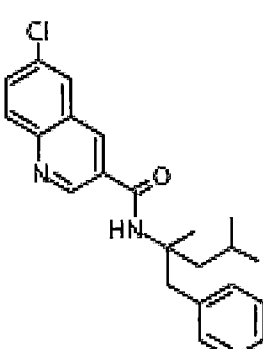
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-55	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁-3-烯基)-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺		1.16	381	G	94 - 96
E-56	N-(1-苄基-3-氟-1,3-二甲基-丁基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.08	383	G	
E-57	N-(1-苄基-3-氟-1,3-二甲基-丁基)喹啉-3-甲醯胺		1.07	365	G	
E-58	N-(1-苄基-3-羥基-1,3-二甲基-丁基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.02	381	G	
E-59	N-[1-[二氟(苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲醯胺		1.12	383	G	

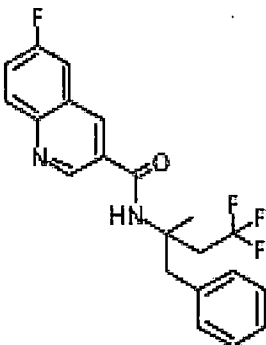
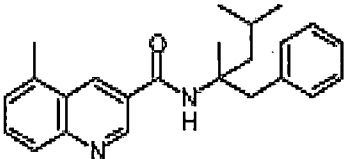
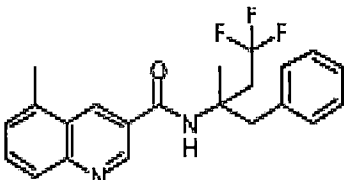
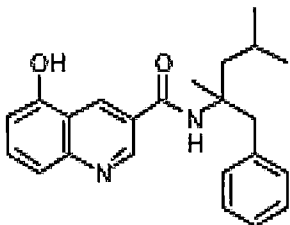
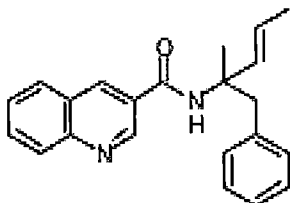
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-60	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-8-氯-喹啉-3-甲醯胺		1.11	408	G	141 - 144
E-61	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-8-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.14	387	G	120 - 123
E-62	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-8-氰基-喹啉-3-甲醯胺		1.06	398	G	175 - 179
E-63	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-6-甲氧基-喹啉-3-甲醯胺		1.13	377	G	102 - 105
E-64	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-5-氯-喹啉-3-甲醯胺		1.23	381-383	G	50 - 60
E-65	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-7-氯-喹啉-3-甲醯		1.22	381-383	G	172 - 174

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
	胺					
E-66	8-氟-N-[3,3,3-三氟-1-[(4-氟苯基)甲基]-1-甲基-丙基]喹啉-3-甲醯胺		1.07	409	G	146 - 147
E-67	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-7-氰基-喹啉-3-甲醯胺		1.14	372	G	170 - 172
E-68	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-5-氯-喹啉-3-甲醯胺		1.14	407-40 9	G	85 - 88
E-69	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-7-氯-喹啉-3-甲醯胺		1.14	407-40 9	G	174 - 176
E-70	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-7-氰基-喹啉-3-甲醯胺		1.06	398	G	172 - 174

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-71	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-6-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.87	361	W	
E-72	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-7-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.84	361	W	
E-73	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-6-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.86	365	W	
E-74	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-5-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.89	365	W	
E-75	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-5-甲氧基-喹啉-3-甲醯胺		1.82	377	W	

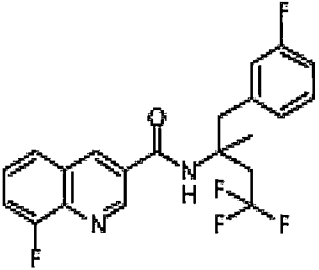
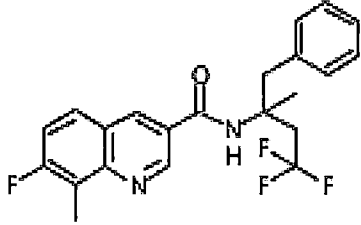
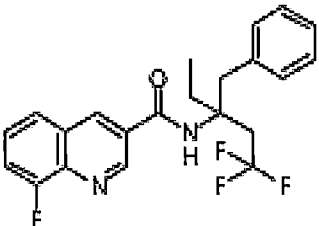
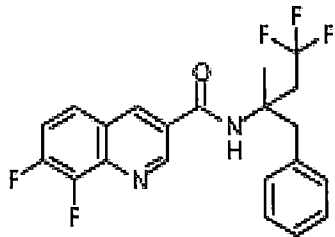
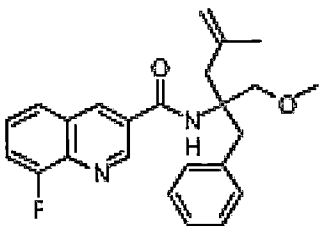
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-76	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-6-羥基-喹啉-3-甲醯胺		1.52	363	W	
E-77	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-6-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.70	387	W	
E-78	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-6-氯-喹啉-3-甲醯胺		1.81	407	W	
E-79	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-7-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.68	387	W	

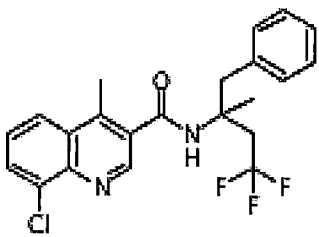
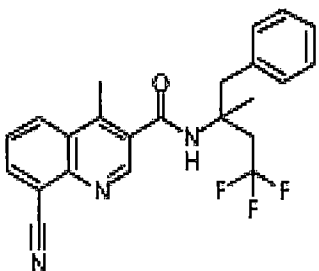
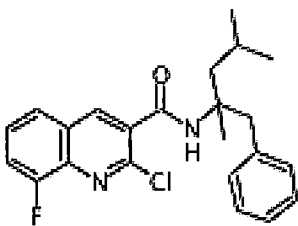
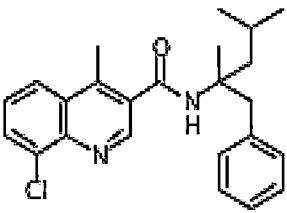
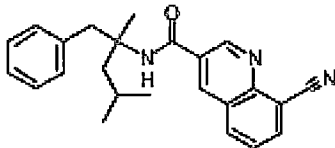
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-80	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-5-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.72	391	W	
E-81	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-5-甲氧基-喹啉-3-甲醯胺		1.66	403	W	
E-82	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-6-羥基-喹啉-3-甲醯胺		1.37	389	W	
E-83	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-6-氯-喹啉-3-甲醯胺		1.98	381	W	

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-84	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-6-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.69	391	W	
E-85	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-5-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.17	361	G	79-81
E-86	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-5-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.09	387	G	101 - 103
E-87	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-5-羥基-喹啉-3-甲醯胺		1.01	363	G	90 - 95
E-88	N-[(E)-1-苄基-1-甲基-丁-2-烯基]喹啉-3-甲醯胺		1.05	331	G	

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-89	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-8-氟-2-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.09	405	G	
E-90	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-8-氟-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.08	404	G	154 - 158
E-91	N-[1-苄基-1-(三氟甲基)丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.15	405	G	
E-92	N-[1-苄基-1-(三氟甲基)丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.13	403	G	
E-93	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-8-氯-7-氟-喹啉-3-甲醯胺					150 - 152

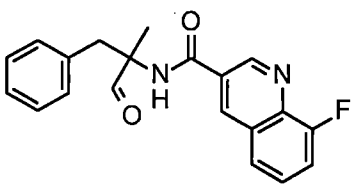
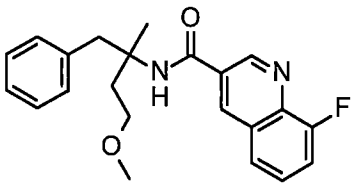
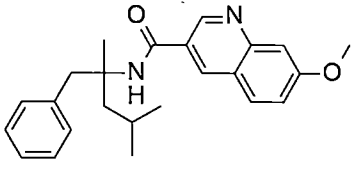
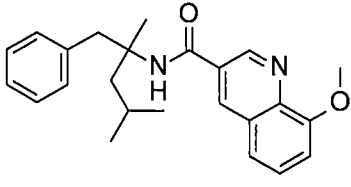
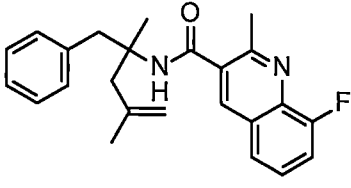
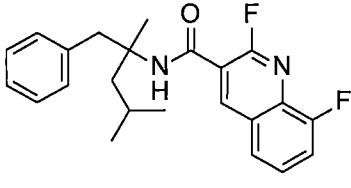
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-94	N-(1-苄基-3,3-二氟-1-甲基-烯丙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.05	371	G	99 - 101
E-95	N-(1-苄基-3,3-二氟-1-甲基-丙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.01	373	G	
E-96	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-4-氯-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.13	425	G	
E-97	N-(1-苄基-3-氯-3,3-二氟-1-甲基-丙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.10	407-409	G	
E-98	8-氟-N-[3,3,3-三氟-1-(2-氟苯基)甲基]-1-甲基-丙基]喹啉-3-甲醯胺		1.07	409	G	131 - 133

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-99	8-氟-N-[3,3,3-三氟-1-[(3-氟苯基)甲基]-1-甲基-丙基]喹啉-3-甲醯胺		1.07	409	G	149 - 151
E-100	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-7-氟-8-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.17	405	G	127 - 129
E-101	N-(1-苄基-1-乙基-3,3,3-三氟-丙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.11	405	G	127 - 129
E-102	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺		1.10	409	G	158 - 160
E-103	N-[1-苄基-1-(甲氧基甲基)-3-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.13	393	G	147 - 149

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-104	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-8-氯-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.13	421	G	184 - 186
E-105	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-8-氰基-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.07	412	G	194 - 197
E-106	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-2-氯-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.21	399	G	106 - 108
E-107	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-8-氯-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.21	395-397	G	65 - 70
E-108	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-8-氰基-喹啉-3-甲醯胺		1.14	372	G	160 - 162

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-109	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-8-氰基-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.15	386	G	
E-110	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-8-氯-2-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.16	422	G	176 - 179
E-111	N-(1-苄基-2-環丁基-1-甲基-乙基)喹啉-3-甲醯胺		1.16	359	G	88 - 90
E-112	N-(1-苄基-2-環丁基-1-甲基-乙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.18	377	G	125 - 127
E-113	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-8-氰基-2-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.10	412	G	136 - 140

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-114	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-8-氟-喹啉-3-硫代甲醯胺		1.28	382	G	150-153
E-115	N-(1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基)-8-氟-喹啉-3-硫代甲醯胺		1.19	408	G	173-175
E-116	N-(1-苄基-2,2-二乙氧基-1-甲基-乙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.07	411	G	
E-117	N-(1-苄基-2-甲氧亞-1-甲基-乙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.01	366	G	
E-118	N-(1-苄基-3-甲氧基-1,3-二甲基-丁基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.14	395	G	118-120
E-119	N-(1-苄基-3-羥基-1-甲基-丙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		0.88	353	G	

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-120	N-(1-苄基-1-甲基-2-側氧基-乙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		0.92	337	G	
E-121	N-(1-苄基-3-甲氧基-1-甲基-丙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.02	367	G	
E-122	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-7-甲氧基-喹啉-3-甲醯胺		1.14	377	G	136-138
E-123	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-8-甲氧基-喹啉-3-甲醯胺		1.11	377	G	155-156
E-124	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁-3-烯基)-8-氟-2-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.14	377	G	
E-125	N-(1-苄基-1,3-二甲基-丁基)-2,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺		1.23	383	G	

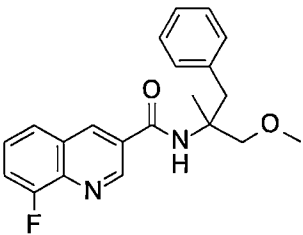
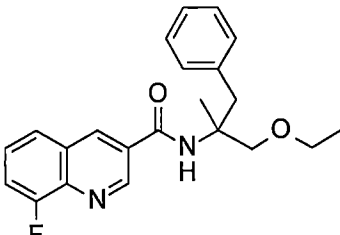
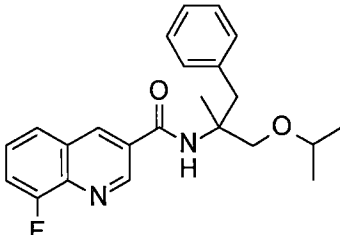
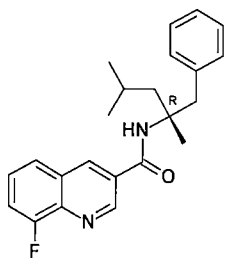
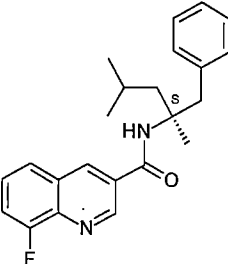
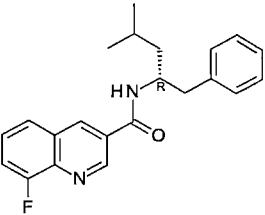
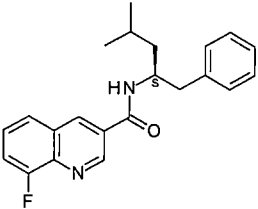
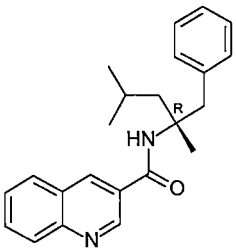
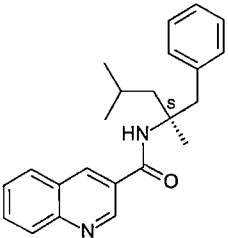
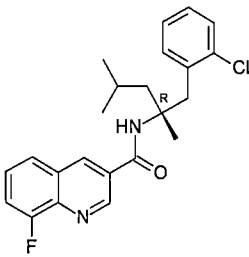
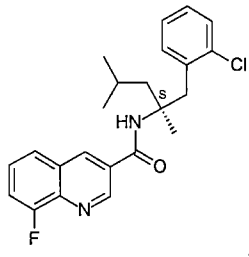
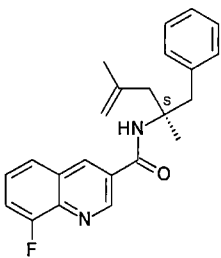
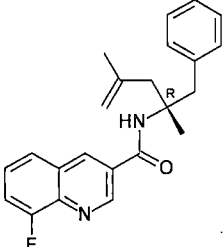
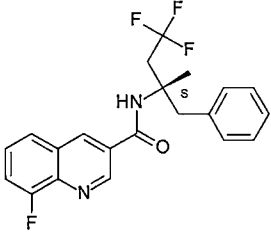
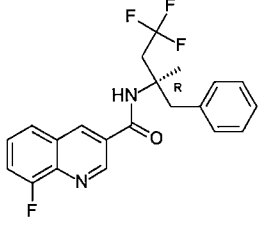
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	方法	MP °C
E-126	N-(1-苄基-2-甲氧基-1-甲基-乙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.00	353	G	
E-127	N-(1-苄基-2-乙氧基-1-甲基-乙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.06	367	G	
E-128	N-(1-苄基-2-異丙氧基-1-甲基-乙基)-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.13	381	G	

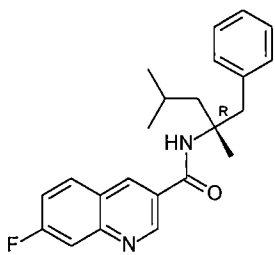
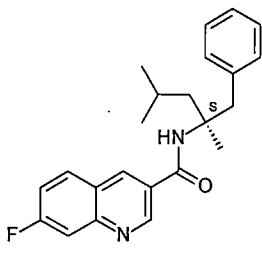
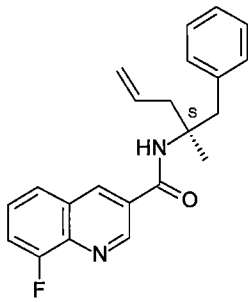
表 F：作為單個鏡像異構物的具有化學式 (I) 之化合物的物理數據

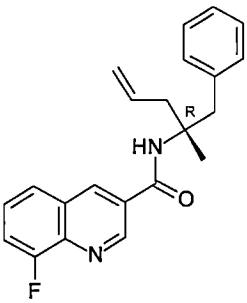
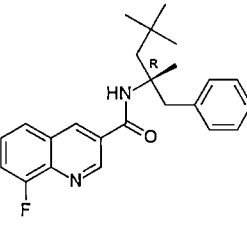
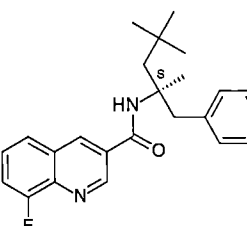
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	$[\alpha]_D^{25}$	方法
F-1	N-[(1R)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.32	365	-90.79°	SFC： 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa PDA 檢測器 沃 特 斯 Acquity UPC <sup>2</sup> 柱：大賽璐 SFC CHIRALPAK® IA, 3 μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相： A: CO <sub>2</sub> B: MeOH 梯度：25% B 在 1.8 min 內 ABPR：1800 psi 流 速：2.0 mL/min 檢 測： 240 nm 樣 品 濃 度：1 mg/mL 在 Hept/EtOH 90/10 中 注 射：3 μL
F-2	N-[(1S)-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		0.97	365	+92.65°	樣 品 濃 度：1 mg/mL 在 Hept/EtOH 90/10 中 注 射：3 μL
F-3	N-[(1R)-1-苄基-3-甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		3.43	351		SFC：沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa PDA 檢測器 沃 特 斯 Acquity

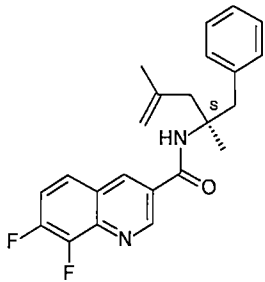
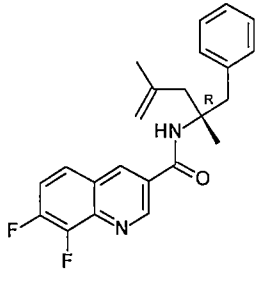
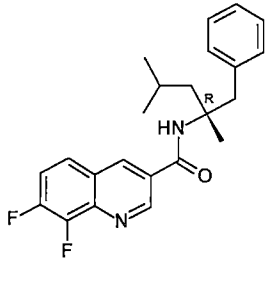
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	$[\alpha]_D^{20}$	方法
F-4	N-[(1 <i>S</i> )-1-苄基-3-甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		2.61	351		UPC <sup>2</sup> 柱:大賽璐SFC CHIRALPAK® ID, 3 μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相: A: CO <sub>2</sub> B: iPr 梯度: 15% B在 4.8 min 內 ABPR: 1800 psi 流速: 2.0 mL/min 檢測: 235 nm 樣品濃度: 1 mg/mL在 ACN/iPr 50/50 中注射: 1 μL
F-5	N-[(1 <i>R</i> )-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲醯胺		1.59	348		SFC: 沃特斯Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa PDA 檢測器 沃特斯Acquity
F-6	N-[(1 <i>S</i> )-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]喹啉-3-甲醯胺		1.02	348		UPC <sup>2</sup> 柱:大賽璐SFC CHIRALPAK® IA, 3 μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相: A: CO <sub>2</sub> B: EtOH 梯度: 30% B在 1.8 min 內 ABPR: 1800 psi 流速: 2.0 mL/min 檢測:

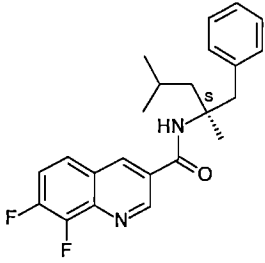
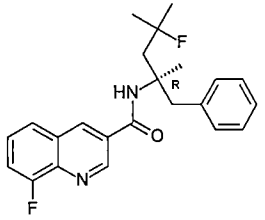
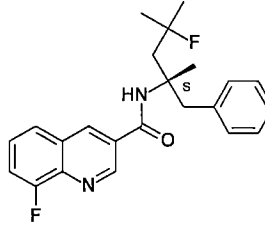
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	$[\alpha]_D^{20}$	方法
						232 nm 樣品濃度：1 mg/mL 在 ACN/iPr 50/50 中注射：1 $\mu$ L
F-7	N-[(1 <i>R</i> )-1-[(2-氯苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.61	399		SFC：沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa PDA 檢測器 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> 柱：大賽璐 SFC CHIRALPAK® IA, 3 $\mu$ m, 0.3 cm x 10 cm, 40°C
F-8	N-[(1 <i>S</i> )-1-[(2-氯苯基)甲基]-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.21	399		流動相：A：CO <sub>2</sub> B：MeOH 梯度：20%-40% B 在 1.8 min 內 ABPR：1800 psi 流速：2.0 mL/min 檢測：235 nm 樣品濃度：1 mg/mL 在 ACN/iPr 50/50 中注射：1 $\mu$ L
F-9	N-[(1 <i>S</i> )-1-苄基-1,3-二甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉		8.10	363		沃特斯 UPLC-Hclass DAD 檢測器 沃特斯 UPLC 柱：大賽璐

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	$[\alpha]_D^{20}$	方法
	-3-甲醯胺					CHIRALPAK® IA, 3 $\mu$ m, 0.46 cm x 10 cm, 流 動相 : Hept/EtOH 80/20
F-10	N-[(1R)-1- -苄基 -1,3-二甲 基-丁-3- 烯基]-8- 氟-喹啉 -3-甲醯 胺		5.99	363		流速 : 1.0 mL/min 檢測 : 235 nm 樣品濃 度 : 1 mg/mL 在 ACN/Hept 50/50 中注射 : 2 $\mu$ L
F-11	N-[(1S)-1- -苄基 -3,3,3-三 氟-1-甲 基-丙 基]-8-氟- 喹啉-3- 甲醯胺		1.70	391	-109.9 °	SFC : 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa  PDA 檢測器沃 特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> 柱:大賽璐 SFC
F-12	N-[(1R)-1- -苄基 -3,3,3-三 氟-1-甲 基-丙 基]-8-氟- 喹啉-3- 甲醯胺		2.16	391	+111. 9°	CHIRALPAK® ID, 3 $\mu$ m, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相 : A : CO <sub>2</sub> B : iPr 梯度 : 15% B 在 2.8 min 內 ABPR : 1800 psi  流速 : 2.0 mL/min 檢測 : 235 nm, 樣品濃 度 : 1 mg/mL 在 ACN/iPr 50/50 中注射 : 1 $\mu$ L

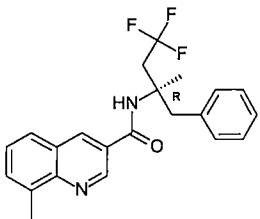
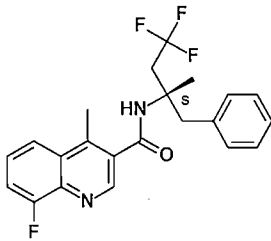
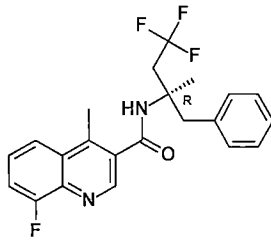
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	$[\alpha]_D^{20}$	方法
F-13	N-[(1 <i>R</i> )-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-7-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.53	365		SFC : 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa PDA 檢測器 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> 柱:大賽璐 SFC
F-14	N-[(1 <i>S</i> )-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-7-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.15	365		CHIRALPAK® IA, 3 μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相 : A:CO <sub>2</sub> B:MeOH 梯度 : 20%-40% B在1.8 min內 ABPR : 1800 psi 流速 : 2.0 mL/min 檢測 : 230 nm 樣品濃度 : 1 mg/mL 在 ACN/iPr 50/50 中注射 : 1 μL
F-15	N-[(1 <i>S</i> )-1-苄基-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		2.17	349		SFC : 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa PDA 檢測器 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> 柱:大賽璐

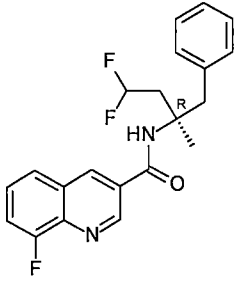
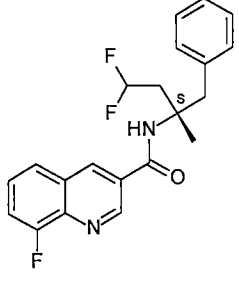
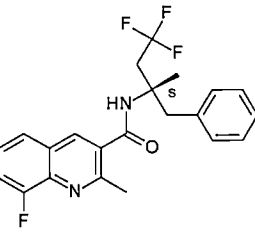
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	$[\alpha]_D^{20}$	方法
F-16	N-[(1 <i>R</i> )-1-苄基-1-甲基-丁-3-烯基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.58	349		SFC CHIRALPAK® IA, 3 μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相: A:CO <sub>2</sub> B:MeOH 梯度: 25% B在 4.8 min 內 ABPR: 1800 psi 流速: 2.0 mL/min 檢測: 235 nm 樣品濃 度: 1 mg/mL在 ACN/iPr 50/50 中注射: 1 μL
F-17	N-[(1 <i>R</i> )-1-苄基-1,3,3-三甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.45	379		SFC: 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa PDA 檢測器沃 特斯 Acquity UPC <sup>2</sup>
F-18	N-[(1 <i>S</i> )-1-苄基-1,3,3-三甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		0.94	379		柱: 大賽璐SFC CHIRALPAK® IA, 3 μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相: A: CO <sub>2</sub> B: MeOH 梯 度: 25% B在1.8 min 內 ABPR: 1800 psi 流速: 2.0

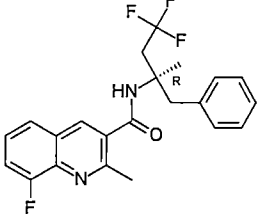
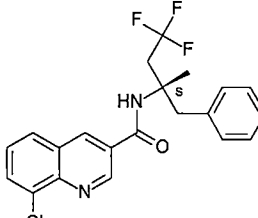
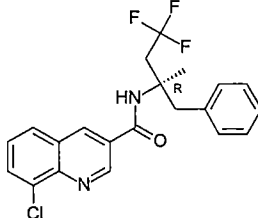
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	$[\alpha]_D^{20}$	方法
						ml/min 檢測： 235 nm 樣品濃度： 1 mg/mL 在 ACN/iPr 50/50 中注射：1 $\mu$ L
F-19	N-[(1 <i>S</i> )-1-苄基-1,3-二甲基-丁-3-烯基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺		4.96	381		柱：大賽璐SFC CHIRALPAK® IA, 3 $\mu$ m, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相：A: CO <sub>2</sub> B: iPr 梯度：15% B在5.8 min內
F-20	N-[(1 <i>R</i> )-1-苄基-1,3-二甲基-丁-3-烯基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺		4.11	381		ABPR: 1800 psi 流速: 2.0 ml/min 檢測: 233 nm 樣品濃度: 1 mg/mL 在 ACN/iPr 50/50 中 注射: 1 $\mu$ L
F-21	N-[(1 <i>R</i> )-1-苄基-1,3-二甲基-丁-3-烯基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺		1.50	383		SFC: 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa PDA 檢測器 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> 柱: 大賽璐SFC

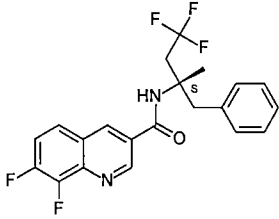
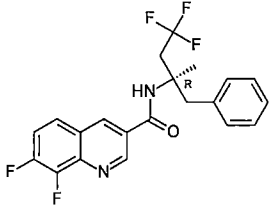
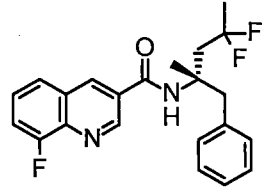
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	$[\alpha]_D^{20}$	方法
F-22	N-[(1 <i>S</i> )-1-苄基-1,3-二甲基-丁基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺		1.09	383		<p>CHIRALPAK® IA, 3 <math>\mu</math>m, 0.3 cm x 10 cm, 40°C</p> <p>流動相: A: CO<sub>2</sub> B: MeOH 梯度: 25% B在1.8 min內</p> <p>ABPR: 1800 psi 流速: 2.0 ml/min</p> <p>檢測: 233 nm</p> <p>樣品濃度: 1 mg/mL 在 ACN/iPr 50/50 中</p> <p>注射: 1 <math>\mu</math>L</p>
F-23	N-[(1 <i>R</i> )-1-苄基-3-氟-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		0.88	383		<p>SFC:</p> <p>IA, 3 <math>\mu</math>m, 0.3 cm x 10 cm, 40°C</p> <p>流動相: A: CO<sub>2</sub> B: MeOH 梯度: 30% B在1.8 min內 ABPR: 1800 psi</p> <p>流速: 2.0 mL/min 檢測: 230 nm 樣品濃度: 1 mg/mL在</p>
F-24	N-[(1 <i>S</i> )-1-苄基-3-氟-1,3-二甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.51	383		<p>流速: 2.0 mL/min 檢測: 230 nm 樣品濃度: 1 mg/mL在</p>

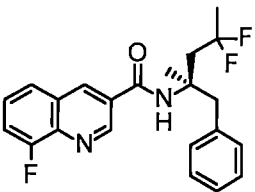
編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	$[\alpha]_D^{20}$	方法
						ACN/iPr 50/50 中注射：1 $\mu$ L
F-25	N-[(1 <i>S</i> )-1-苄基-3,3-二氟-1-甲基-丁基]喹啉-3-甲醯胺		1.81	369		SFC： 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa  PDA 檢測器 沃 特 斯 Acquity UPC <sup>2</sup> 柱：大賽 璐 SFC
F-26	N-[(1 <i>R</i> )-1-苄基-3,3-二氟-1-甲基-丁基]喹啉-3-甲醯胺		1.30	369		CHIRALPAK® IA, 3 $\mu$ m, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相： A：CO <sub>2</sub> B： MeOH 梯度： 30% B 在 1.8 min 內 ABPR：1800 psi  流 速：2.0 mL/min 檢 測： 230 nm 樣 品 濃 度：1 mg/mL 在 ACN/iPr 50/50 中 注 射：1 $\mu$ L
F-27	N-[(1 <i>S</i> )-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-甲基-喹啉-3-甲醯胺		0.45	387		SFC：沃特斯 Acquity UPC <sup>3</sup> /QDa  PDA 檢測器 沃 特 斯 Acquity UPC <sup>3</sup> 柱：大賽 璐 SFC CHIRALPAK®

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	$[\alpha]_D^{25}$	方法
F-28	N-[(1 <i>R</i> )-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.37	387		AY, 3 $\mu$ m, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相: A: CO <sub>2</sub> B: EtOH 梯度: 30% B 在 1.8 min 內 ABPR: 1800 psi 流速: 2.0 mL/min 檢測: 2338 nm 樣品濃度: 1 mg/mL 在 ACN/iPr 50/50 中注射: 1 $\mu$ L
F-29	N-[(1 <i>S</i> )-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.97	405		SFC: 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa PDA 檢測器 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> 柱: 大賽璐 SFC CHIRALPAK® OZ, 3 $\mu$ m, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相: A: CO <sub>2</sub> B: iPr 梯度: 15% B 在 1.8 min 內 ABPR: 1800 psi 流速: 2.0 mL/min 檢測: 220 nm 樣品濃
F-30	N-[(1 <i>R</i> )-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-4-甲基-喹啉-3-甲醯胺		1.03	405		ABPR: 1800 psi 流速: 2.0 mL/min 檢測: 220 nm 樣品濃

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	$[\alpha]_D^{20}$	方法
						度：1 mg/mL在 ACN/iPr 50/50 中注射：1 $\mu$ L
F-31	N-[(1R)-1-苄基-3,3-二氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.84	373		SFC： 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa PDA 檢測器 沃 特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> 柱：大賽璐 SFC CHIRALPAK® IF, 3 $\mu$ m, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相：A：CO <sub>2</sub> B：MeOH 梯 度：30% B在4.8 min內 ABPR：1800 psi 流速：2.0 mL/min 檢測： 220 nm 樣品濃 度：1 mg/mL在 ACN/iPr 50/50 中注射：1 $\mu$ L
F-32	N-[(1S)-1-苄基-3,3-二氟-1-甲基-丙基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		1.03	373		
F-33	N-[(1S)-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟		3.05	405		SFC：沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa PDA 檢測器 沃 特斯 Acquity

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	$[\alpha]_D^{20}$	方法
	-2-甲基-喹啉-3-甲醯胺					UPC <sup>2</sup> 柱:大賽璐 SFC CHIRALPAK®
F-34	N-[(1 <i>R</i> )-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氟-2-甲基-喹啉-3-甲醯胺		3.67	405		IC, 3 μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相: A: CO <sub>2</sub> B: iPr 梯度: 10% B 在 4.8 min 內 ABPR: 1800 psi 流速: 2.0 mL/min 檢測: 220 nm 樣品濃度: 1 mg/mL 在 ACN/iPr 50/50 中注射: 1 μL
F-35	N-[(1 <i>S</i> )-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氯-喹啉-3-甲醯胺		4.99	407		SFC: 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa PDA 檢測器 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> 柱:大賽璐 SFC
F-36	N-[(1 <i>R</i> )-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-8-氯-喹啉-3-甲醯胺		1.16	407		CHIRALPAK® OZ, 3 μm, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相: A: CO <sub>2</sub> B: iPr 梯度: 15% B 在 2.8 min 內 ABPR: 1800 psi 流速: 2.0 ml/min 檢測:

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	$[\alpha]_D^{20}$	方法
						237 nm 樣品濃度：1 mg/mL 在 ACN/iPr 50/50 中注射：1 $\mu$ L
F-37	N-[(1 <i>S</i> )-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺		1.05	409		SFC：沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa PDA 檢測器 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> 柱：大賽璐 SFC CHIRALPAK® OZ, 3 $\mu$ m, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相： A：CO <sub>2</sub> B：iPr 梯度：10% B 在 2.8 min 內 ABPR：1800 psi 流速：2.0 mL/min 檢測： 233 nm 樣品濃度：1 mg/mL 在 ACN/iPr 50/50 中注射：1 $\mu$ L
F-38	N-[(1 <i>R</i> )-1-苄基-3,3,3-三氟-1-甲基-丙基]-7,8-二氟-喹啉-3-甲醯胺		1.51	409		
F-39	N-[(1 <i>S</i> )-1-苄基-3,3-二氟-1-甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		3.30	387		SFC：沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> /QDa PDA 檢測器 沃特斯 Acquity UPC <sup>2</sup> 柱：大賽璐 SFC

編號	IUPAC名稱	結構	RT (min)	測量的 [M+H]	$[\alpha]_D^{25}$	方法
F-40	N-[(1R)-1-苄基-3,3-二氟-1-甲基-丁基]-8-氟-喹啉-3-甲醯胺		2.10	387		CHIRALPAK® OZ, 3 $\mu$ m, 0.3 cm x 10 cm, 40°C 流動相: A: CO <sub>2</sub> B: iPr 梯度: 12% B在 4.8 min 內 ABPR: 1800 psi 流速: 2.0 mL/min 檢測: 234 nm 樣品濃度: 1 mg/mL在 ACN/iPr 50/50 中注射: 1 $\mu$ L

### 生物學實施例

灰葡萄孢菌 (*Botryotinia fuckeliana* 或 *Botrytis cinerea*) /液體培養 (灰黴病)

將來自低溫儲存的真菌分生孢子直接混入營養肉湯 (沃格爾 (Vogels) 肉湯) 中。在將試驗化合物的 (DMSO) 溶液置於微量滴定板 (96 孔規格) 中之後, 添加含有真菌孢子的營養肉湯。將該等測試板在 24°C 進行培養並且施用之後 3-4 天藉由光度法測定對生長的抑制。

當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病發展的未處理的對照相比時, 表 E 和 F 的以下化合物在 200 ppm 處對灰葡萄孢菌給出至少 80% 的控制:

E-1、E-2、E-3、E-5、E-6、E-7、E-8、E-10、E-11、E-12、E-13、E-14、E-15、E-16、E-17、E-18、E-19、E-20、E-21、E-22、E-23、E-24、E-25、E-26、E-27、E-28、E-29、E-30、E-31、E-32、E-33、E-34、E-35、E-36、E-37、E-38、

E-39、E-40、E-41、E-42、E-43、E-44、E-45、E-46、E-47、E-48、E-49、E-50、  
 E-51、E-52、E-53、E-54、E-55、E-56、E-57、E-58、E-59、E-60、E-61、E-62、  
 E-63、E-64、E-65、E-66、E-67、E-69、E-70、E-71、E-72、E-73、E-74、E-75、  
 E-76、E-77、E-79、E-80、E-81、E-82、E-84、E-85、E-86、E-87、E-88、E-89、  
 E-90、E-91、E-92、E-93、E-94、E-95、E-96、E-97、E-98、E-99、E-100、E-101、  
 E-102、E-103、E-104、E-106、E-107、E-109、E-110、E-111、E-112、E-113、  
 E-114、E-115、E-116、E-117、E-118、E-119、E-121、E-123、E-124、E-125、  
 F-1、F-2、F-3、F-4、F-5、F-6、F-7、F-8、F-9、F-10、F-11、F-12、F-13、F-14、  
 F-16、F-17、F-18、F-19、F-20、F-21、F-22、F-23、F-24、F-25、F-26、F-27、  
 F-28、F-29、F-30、F-31、F-32、F-33、F-34、F-35、F-36、F-37、F-38、F-39、  
 F-40

黃色镰刀菌 (*Fusarium culmorum*) / 液體培養 (赤黴病)

將來自低溫儲存的真菌分生孢子直接混入營養肉湯 (PDB 馬鈴薯右旋糖肉湯) 中。在將試驗化合物的 (DMSO) 溶液置於微量滴定板 (96 孔規格) 中之後，添加含有真菌孢子的營養肉湯。將該等測試板在 24°C 進行培養並且施用之後 3-4 天藉由光度法測定對生長的抑制。

當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病發展的未處理的對照相比時，表 E 和 F 的以下化合物在 200 ppm 處對黃色镰刀菌給出至少 80% 的控制：

E-1、E-2、E-4、E-5、E-6、E-7、E-8、E-10、E-11、E-12、E-13、E-14、  
 E-15、E-16、E-17、E-18、E-19、E-20、E-21、E-22、E-23、E-24、E-25、E-26、  
 E-27、E-28、E-29、E-30、E-31、E-32、E-33、E-34、E-35、E-36、E-37、E-38、  
 E-39、E-40、E-41、E-42、E-43、E-44、E-45、E-46、E-47、E-48、E-49、E-50、

E-51、E-52、E-53、E-54、E-55、E-56、E-57、E-58、E-59、E-60、E-61、E-62、  
 E-64、E-65、E-66、E-67、E-68、E-69、E-70、E-71、E-72、E-73、E-74、E-75、  
 E-76、E-77、E-78、E-79、E-80、E-81、E-82、E-84、E-85、E-86、E-87、E-88、  
 E-89、E-90、E-91、E-92、E-93、E-94、E-95、E-96、E-97、E-98、E-99、E-100、  
 E-101、E-102、E-103、E-104、E-105、E-106、E-107、E-109、E-110、E-111、  
 E-112、E-113、E-114、E-115、E-116、E-117、E-118、E-119、E-120、E-121、  
 E-123、E-124、E-125、F-1、F-2、F-3、F-4、F-5、F-6、F-7、F-8、F-9、F-10、  
 F-11、F-12、F-13、F-14、F-16、F-17、F-18、F-19、F-20、F-21、F-22、F-23、  
 F-24、F-25、F-26、F-27、F-28、F-29、F-30、F-31、F-32、F-33、F-34、F-35、  
 F-36、F-37、F-38、F-39、F-40

*黃色镰刀菌/小麥/小穗預防性 (赤黴病 (Head blight))*

將小麥栽培品種 Monsun 的小穗置於多孔板 (24 孔規格) 的瓊脂上，並且用稀釋在水中的配製的試驗化合物進行噴霧。在施用後 1 天之後，用真菌的孢子懸浮液接種該等小穗。在人工氣候室中在 72 h 半黑暗隨後係的 12 h 光照/12 h 黑暗的光方案下，在 20°C 和 60% rh 培養接種的小穗，並且在未處理的對照小穗上出現適當水平的疾病損害時 (施用後 6-8 天之後)，作為與未處理的相比時的疾病控制百分比來評估化合物的活性。

當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病發展的未處理的對照相比時，表 E 和 F 的以下化合物在 200 ppm 處對黃色镰刀菌給出至少 80% 的控制：

E-1、E-5、E-6、E-10、E-11、E-12、E-13、E-15、E-16、E-17、E-19、E-20、  
 E-21、E-22、E-23、E-24、E-25、E-26、E-28、E-29、E-30、E-35、E-36、E-38、  
 E-39、E-42、E-43、E-44、E-48、E-49、E-50、E-51、E-52、E-55、E-56、E-57、

E-58、E-59、E-60、E-61、E-62、E-66、E-67、E-69、E-70、E-71、E-72、E-74、  
 E-75、E-76、E-77、E-79、E-80、E-81、E-82、E-84、E-85、E-86、E-88、E-89、  
 E-90、E-91、E-92、E-93、E-94、E-95、E-96、E-97、E-98、E-99、E-100、E-101、  
 E-102、E-103、E-104、E-105、E-106、E-107、E-109、E-113、E-114、E-125、  
 F-1、F-2、F-3、F-4、F-5、F-9、F-10、F-11、F-12、F-13、F-14、F-16、F-17、  
 F-18、F-19、F-20、F-21、F-23、F-24、F-25、F-26、F-27、F-28、F-29、F-31、  
 F-32、F-33、F-35、F-36、F-37、F-39、F-40

瓜小叢殼菌 (*Glomerella lagenarium*) (瓜類炭疽菌 (*Colletotrichum lagenarium*)) / 液體培養 (炭疽病 (*Anthraxnose*))

將來自低溫儲存的真菌分生孢子直接混入營養肉湯 (PDB 馬鈴薯右旋糖肉湯) 中。在將試驗化合物的 (DMSO) 溶液置於微量滴定板 (96 孔規格) 中之後，添加含有真菌孢子的營養肉湯。將該等測試板在 24°C 下培養並且施用 3-4 天以後藉由光度法測量對生長的抑制。

當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病發展的未處理的對照相比時，表 E 和 F 的以下化合物在 200 ppm 處對瓜小叢殼菌 (*Glomerella lagenarium*) 給出至少 80% 的控制：

E-1、E-2、E-5、E-6、E-12、E-13、E-14、E-15、E-20、E-21、E-22、E-23、  
 E-24、E-25、E-26、E-27、E-28、E-29、E-30、E-31、E-32、E-33、E-34、E-35、  
 E-36、E-37、E-38、E-39、E-40、E-42、E-43、E-44、E-45、E-46、E-47、E-48、  
 E-49、E-50、E-51、E-52、E-53、E-54、E-55、E-56、E-57、E-58、E-60、E-61、  
 E-62、E-66、E-69、E-79、E-86、E-87、E-89、E-90、E-91、E-92、E-93、E-94、  
 E-95、E-96、E-97、E-98、E-99、E-100、E-101、E-102、E-103、E-104、E-106、

E-111、E-112、E-113、E-114、E-115、E-118、E-125、F-1、F-2、F-3、F-4、  
F-5、F-6、F-7、F-8、F-9、F-10、F-11、F-12、F-13、F-14、F-16、F-17、F-18、  
F-19、F-20、F-21、F-22、F-23、F-24、F-25、F-26、F-27、F-28、F-29、F-30、  
F-31、F-32、F-33、F-34、F-35、F-36、F-37、F-38、F-39、F-40

小麥全蝕病菌 (*Gaeumannomyces graminis*) /液體培養 (谷類全蝕病  
(*Take-all*))

將來自低溫儲存的菌絲體片段直接混入營養肉湯 (PDB 馬鈴薯右旋糖  
肉湯) 中。在將試驗化合物的 (DMSO) 溶液置於微量滴定板 (96 孔規格)  
中之後, 添加含有真菌孢子的營養肉湯。將該等測試板在 24°C 進行培養並  
且施用之後 4-5 天藉由光度法測定對生長的抑制。

當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病發展的未處理的對照相比時, 表 E  
和 F 的以下化合物在 200 ppm 處對小麥全蝕病菌給出至少 80% 的控制:

E-1、E-2、E-6、E-7、E-8、E-10、E-13、E-14、E-17、E-19、E-20、E-21、  
E-22、E-23、E-24、E-25、E-26、E-27、E-28、E-35、E-37、E-38、E-39、E-40、  
E-42、E-43、E-45、E-46、E-47、E-48、E-53、F-1、F-2、F-3、F-4、F-5、F-6、  
F-7、F-8、F-10、F-16、F-17、F-18

雪腐明梭孢 (*Monographella nivalis*) (雪黴葉枯菌 (*Microdochium nivale*))  
/液體培養 (穀類根腐病)

將來自低溫儲存的真菌分生孢子直接混入營養肉湯 (PDB 馬鈴薯右旋  
糖肉湯) 中。在將試驗化合物的 (DMSO) 溶液置於微量滴定板 (96 孔規  
格) 中之後, 添加含有真菌孢子的營養肉湯。將該等測試板在 24°C 進行培  
養並且施用之後 4-5 天藉由光度法測定對生長的抑制。

當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病發展的未處理的對照相比時，表 E 和 F 的以下化合物在 200 ppm 處對雪腐明梭孢給出至少 80% 的控制：

E-1、E-2、E-5、E-6、E-12、E-13、E-14、E-20、E-21、E-22、E-23、E-24、  
E-26、E-27、E-28、E-30、E-31、E-33、E-34、E-35、E-36、E-37、E-38、E-42、  
E-43、E-45、E-48、E-49、E-53、E-54、E-55、E-56、E-57、E-58、E-59、E-60、  
E-61、E-88、E-92、E-97、E-99、E-103、E-112、E-114、E-116、E-117、E-118、  
E-121、E-122、E-123、F-1、F-2、F-4、F-5、F-8、F-9、F-10、F-18、F-20、  
F-23、F-24、F-25、F-26、F-27、F-29、F-30、F-32、F-39

*落花生球腔菌 (Mycosphaerella arachidis)* (*落花生尾孢菌 (Cercospora arachidicola)*) / 液體培養 (早期葉斑病)

將來自低溫儲存的真菌分生孢子直接混入營養肉湯 (PDB 馬鈴薯右旋糖肉湯) 中。在將試驗化合物的 (DMSO) 溶液置於微量滴定板 (96 孔規格) 中之後，添加含有真菌孢子的營養肉湯。將該等測試板在 24°C 進行培養並且施用之後 4-5 天藉由光度法測定對生長的抑制。

當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病發展的未處理的對照相比時，表 E 和 F 的以下化合物在 200 ppm 處對落花生球腔菌給出至少 80% 的控制：

E-2、E-35、E-55、F-26

*稻瘟病菌 (Magnaporthe grisea)* (*稻梨孢 (Pyricularia oryzae)*) / 液體培養 (稻瘟病)

將來自低溫儲存的真菌分生孢子直接混入營養肉湯 (PDB 馬鈴薯右旋糖肉湯) 中。在將試驗化合物的 (DMSO) 溶液置於微量滴定板 (96 孔規格) 中之後，添加含有真菌孢子的營養肉湯。將該等測試板在 24°C 進行培

養並且施用之後 3-4 天藉由光度法測定對生長的抑制。

當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病發展的未處理的對照相比時，表 E 和 F 的以下化合物在 200 ppm 處對稻瘟病菌給出至少 80% 的控制：

E-5、E-6、E-12、E-14、E-15、E-16、E-17、E-19、E-20、E-21、E-22、  
E-23、E-24、E-25、E-26、E-27、E-28、E-29、E-30、E-31、E-32、E-33、E-34、  
E-35、E-36、E-37、E-38、E-39、E-40、E-42、E-43、E-44、E-45、E-46、E-47、  
E-48、E-49、E-50、E-51、E-52、E-53、E-54、E-55、E-56、E-57、E-58、E-59、  
E-60、E-61、E-62、E-65、E-66、E-69、E-114、F-1、F-37、F-38、F-39、F-40。

*圓核腔菌 (Pyrenophora teres) / 大麥/葉圓片預防性 (網斑病)*

將大麥栽培品種 Hasso 的葉片段置於多孔板 (24 孔規格) 內的瓊脂上，並且用稀釋在水中的配製的試驗化合物噴霧。在施用後 2 天之後用真菌的孢子懸浮液接種該等葉片段。在人工氣候室中在 12 h 光照/12 h 黑暗的光方案下，在 20°C 和 65% rh 培養接種的葉片段，並且在未處理的對照葉片段上出現適當水平的疾病損害時 (施用後 5-7 天之後)，作為與未處理的相比時的疾病控制百分比來評估化合物的活性。

當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病發展的未處理的對照相比時，表 E 和 F 的以下化合物在 200 ppm 處對圓核腔菌給出至少 80% 的控制：

E-14、E-26、E-55、E-114

*禾生球腔菌 (Mycosphaerella graminicola) (小麥殼針孢 (Septoria tritici))*  
*/ 液體培養 (葉枯病 (Septoria blotch))*

將來自低溫儲存的真菌分生孢子直接混入營養肉湯 (PDB 馬鈴薯右旋糖肉湯) 中。在將試驗化合物的 (DMSO) 溶液置於微量滴定板 (96 孔規

格) 中之後，添加含有真菌孢子的營養肉湯。將該等測試板在 24°C 進行培養並且施用之後 4-5 天藉由光度法測定對生長的抑制。

當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病發展的未處理的對照相比時，表 E 和 F 的以下化合物在 200 ppm 處對禾生球腔菌給出至少 80% 的控制：

E-2、E-6、E-55、E-58、E-61、F-2、F-3、F-6、F-24、F-26

核盤菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*) / 液體培養 (棉狀腐病 (cottony rot))

將新培養的液體培養真菌的菌絲體片段直接混入營養肉湯 (沃格爾 (Vogels) 肉湯) 中。在將試驗化合物的 (DMSO) 溶液置於微量滴定板 (96 孔規格) 中之後，添加含有真菌材料的營養肉湯。將該等測試板在 24°C 進行培養並且施用之後 3-4 天藉由光度法測定對生長的抑制。

當與在相同條件下顯示出廣泛的疾病發展的未處理的對照相比時，表 E 和 F 的以下化合物在 20 ppm 處對核盤菌給出至少 80% 的控制：

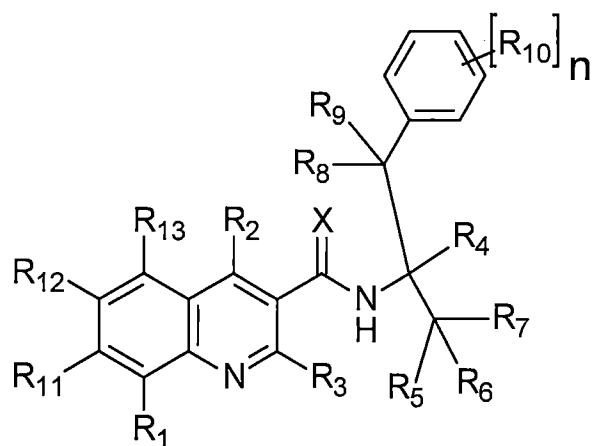
E-6、E-14、E-15、E-20、E-24、E-25、E-26、E-28、E-29、E-34、E-35、  
E-36、E-39、E-47、E-114、F-1、F-2、F-3、F-10

### 【符號說明】

無

# 申請專利範圍

1. 一種具有化學式 (I) 之化合物：



(I)

其中

X 係 O 或 S；

R<sub>1</sub> 係氫、鹵素、甲基、甲氧基或氰基；

R<sub>2</sub> 和 R<sub>3</sub> 各自獨立地是氫、鹵素或甲基；

R<sub>4</sub> 係氫、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、或 C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> 環烷基，其中該烷基和環烷基視情況被獨立地選自以下項的 1 至 3 個取代基取代：鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷氧基以及 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基硫基；

R<sub>5</sub> 和 R<sub>6</sub> 各自獨立地選自氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基硫基；或

R<sub>5</sub> 和 R<sub>6</sub> 與它們所附接的碳原子一起代表 C=O、C=NOR<sub>c</sub>、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 環烷基或 C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 烯基，其中該環烷基和烯基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基硫基；

R<sub>7</sub> 係氫、C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 環烯基、或 C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 炔基，其中該烷基、環烷基、烯基、炔基、環烯基可以視情況被獨立地選

自以下各項的 1 至 4 個取代基取代：鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷氧基、  
羥基和 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基硫基；

R<sub>8</sub> 和 R<sub>9</sub> 各自獨立地選自氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基和 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基；或

R<sub>8</sub> 和 R<sub>9</sub> 與它們所附接的碳原子一起代表 C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 環烷基，其中該環烷基可  
以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>  
烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基硫基；

每個 R<sub>10</sub> 獨立地代表鹵素、硝基、氰基、甲醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 烯基、  
C<sub>2</sub>-C<sub>5</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> 烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 烯基氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub> 炔基氧基、  
C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> 烷基硫基、-C(=NOR<sub>c</sub>)C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> 烷基、或 C<sub>1</sub>-C<sub>5</sub> 烷基羰基，其中該烷基、環  
烷基、烯基、炔基、烷氧基、烯基氧基、炔基氧基和烷基硫基可以視情況  
被獨立地選自以下各項的 1 至 5 個取代基取代：鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷  
氧基、氰基和 C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基硫基；n 係 0、1、2、3、4 或 5；

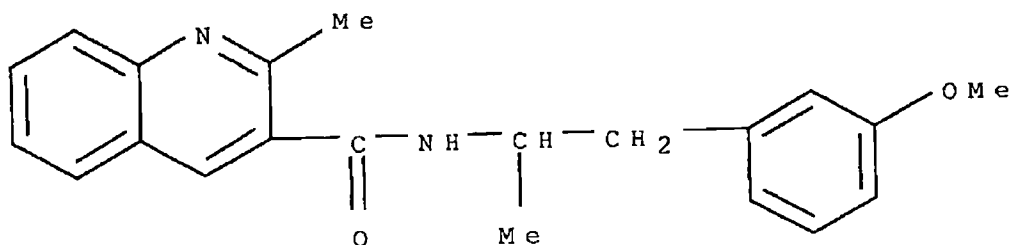
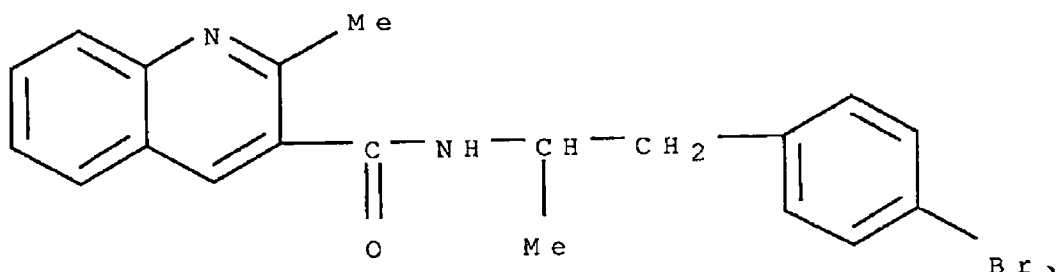
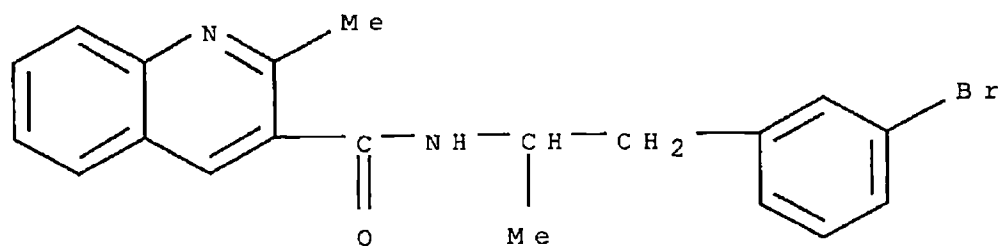
每個 R<sub>c</sub> 獨立地選自氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> 炔基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> 環烷基  
(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>) 烷基和 C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> 環烷基，其中該烷基、環烷基、烯基和炔基基團可以視  
情況被獨立地選自鹵素和氰基的 1 至 3 個取代基取代；

R<sub>11</sub> 係氫、鹵素、甲基、甲氧基或氰基；

R<sub>12</sub> 和 R<sub>13</sub> 各自獨立地選自氫、鹵素、甲基、甲氧基或羥基；

及其鹽和/或 N-氧化物；

其條件係該化合物不是以下化合物之一：



2. 如申請專利範圍第 1 項所述之化合物，其中  $R_1$  係氫、氟、氯、甲基、或氰基。

3. 如申請專利範圍第 1 或 2 項所述之化合物，其中  $R_2$  和  $R_3$  各自獨立地是氫或甲基。

4. 如申請專利範圍第 1、2 或 3 項中任一項所述之化合物，其中  $R_4$  係氫、氰基、 $C_1$ - $C_3$  烷基、或環丙基，其中該烷基和環烷基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、氰基、甲基、甲氧基和甲基硫基。

5. 如申請專利範圍第 1、2、3 或 4 項中任一項所述之化合物，其中  $R_5$  和  $R_6$  各自獨立地選自氫、氟、 $C_1$ - $C_2$  烷基、 $C_1$ - $C_2$  烷氧基和  $C_1$ - $C_2$  烷基硫基；或  $R_5$  和  $R_6$  與它們所附接的碳原子一起代表  $C=O$  或環丙基，其中該環丙基可

以視情況被獨立地選自氟、甲基和氰基的 1 至 2 個取代基取代。

6. 如申請專利範圍第 1、2、3、4 或 5 項中任一項所述之化合物，其中  $R_7$  係  $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_3$ - $C_4$  環烷基、 $C_2$ - $C_4$  烯基、或  $C_2$ - $C_3$  炔基，其中該烷基、環烷基、烯基、炔基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、氰基、甲基、羥基和甲基硫基。

7. 如申請專利範圍第 1、2、3、4、5 或 6 項中任一項所述之化合物，其中  $R_8$  和  $R_9$  各自獨立地選自氫、氟、 $C_1$ - $C_2$  烷基和  $C_1$ - $C_2$  烷氧基；或  $R_8$  和  $R_9$  與它們所附接的碳原子一起代表環丙基，其中該環丙基可以視情況被獨立地選自氟、氰基和甲基的 1 至 2 個取代基取代。

8. 如申請專利範圍第 1、2、3、4、5、6 或 7 項中任一項所述之化合物，其中每個  $R_{10}$  獨立地代表鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_2$ - $C_3$  烯基、 $C_2$ - $C_3$  炔基、環丙基、甲氧基、烯丙氧基、炔丙氧基、或  $C_1$ - $C_2$  烷基硫基，其中該烷基、環丙基、烯基、炔基、甲氧基、烯丙氧基、炔丙氧基和烷基硫基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、甲基、和氰基； $n$  係 0、1、2 或 3。

9. 如申請專利範圍第 1、2、3、4、5、6、7 或 8 項中任一項所述之化合物，其中  $R_{11}$  係氫、氟、氯、甲基或氰基；並且  $R_{12}$  和  $R_{13}$  各自獨立地選自氫、氟、甲基和羥基。

10. 如申請專利範圍第 1 項所述之化合物，其中  $X$  係 O 或 S； $R_1$  係氫、氟、氯、甲基或氰基； $R_2$  和  $R_3$  各自獨立地是氫或甲基； $R_4$  係氫、氰基、 $C_1$ - $C_3$  烷基、或環丙基，其中該烷基和環烷基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、氰基、甲基、甲氧基和甲基硫基； $R_5$  和

R<sub>6</sub> 各自獨立地選自氫、氟、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 烷氧基和 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 烷基硫基；或 R<sub>5</sub> 和 R<sub>6</sub> 與它們所附接的碳原子一起代表 C=O 或環丙基，其中該環丙基可以視情況被獨立地選自氟、甲基和氰基的 1 至 2 個取代基取代；R<sub>7</sub> 係 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> 環烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烯基、或 C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub> 炔基，其中該烷基、環烷基、烯基、炔基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、氰基、甲基、羥基和甲基硫基；R<sub>8</sub> 和 R<sub>9</sub> 各自獨立地選自氫、氟、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 烷基和 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 烷氧基；或 R<sub>8</sub> 和 R<sub>9</sub> 與它們所附接的碳原子一起代表環丙基，其中該環丙基可以視情況被獨立地選自氟、氰基和甲基的 1 至 2 個取代基取代；每個 R<sub>10</sub> 獨立地代表鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub> 烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub> 炔基、環丙基、甲氧基、烯丙氧基、炔丙氧基、或 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 烷基硫基，其中該烷基、環丙基、烯基、炔基、甲氧基、烯丙氧基、炔丙氧基和烷基硫基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、甲基、和氰基；n 係 0、1、2 或 3；R<sub>11</sub> 係氫、氟、氯、甲基或氰基；並且 R<sub>12</sub> 和 R<sub>13</sub> 各自獨立地選自氫、氟、甲基和羥基；或其鹽或 N-氧化物。

11. 如申請專利範圍第 1 項所述之化合物，其中 X 係 O 或 S；R<sub>1</sub> 係氫、氟、甲基或氰基；R<sub>2</sub> 係氫並且 R<sub>3</sub> 係氫或甲基；或 R<sub>2</sub> 係氫或甲基並且 R<sub>3</sub> 係氫；R<sub>4</sub> 係氫、氰基、甲基或乙基，其中該甲基和乙基可以視情況被獨立地選自氟和甲氧基的 1 至 3 個取代基取代；R<sub>5</sub> 和 R<sub>6</sub> 各自獨立地選自氫、氟、甲基、甲氧基和甲基硫基；或 R<sub>5</sub> 和 R<sub>6</sub> 連同它們所附接的碳原子一起表示環丙基；R<sub>7</sub> 係 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub> 環烷基、或 C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub> 烯基，其中該烷基、環烷基和烯基可以視情況被獨立地選自以下各項的 1 至 3 個取代基取代：氟、氯、羥基、氰基和甲基；R<sub>8</sub> 和 R<sub>9</sub> 各自獨立地選自氫、氟和甲基；或 R<sub>8</sub> 和 R<sub>9</sub> 連同它們所

附接的碳原子一起表示環丙基；每個  $R_{10}$  獨立地代表氟、氯、氟基、甲基、環丙基、甲氧基或甲基硫基，其中該甲基、環丙基、甲氧基和甲基硫基可以視情況被獨立地選自氟和氯的 1 至 3 個取代基取代； $n$  係 0、1 或 2； $R_{11}$  係氫、氟、甲基或氯；並且  $R_{12}$  和  $R_{13}$  各自獨立地選自氫、氟和甲基；或其鹽或 N-氧化物。

12. 如申請專利範圍第 1 項所述之化合物，其中  $X$  係 O 或 S； $R_1$  係氫或氟； $R_2$  和  $R_3$  兩者都是氫； $R_4$  係甲基或乙基（其中該甲基和乙基可以視情況被 1 至 3 個氟取代基取代）； $R_5$  和  $R_6$  各自獨立地選自氫和氟； $R_7$  係甲基、乙基、正丙基、異丙基、二級丁基、三級丁基、 $C_3$ - $C_4$  環烷基、或  $C_2$ - $C_4$  烯基，其中該甲基、乙基、正丙基、異丙基、二級丁基、三級丁基、環烷基和烯基可以視情況被獨立地選自氟、氯和甲基的 1 至 3 個取代基取代； $R_8$  和  $R_9$  各自獨立地選自氫或氟；每個  $R_{10}$  獨立地代表氟、氯、氟基或甲基，其中該甲基、環丙基、甲氧基和甲基硫基可以視情況被 1 至 3 個氟取代基取代； $n$  係 0、1 或 2；並且  $R_{11}$  係氫或氟； $R_{12}$  和  $R_{13}$  兩者都是氫；或其鹽或 N-氧化物。

13. 如申請專利範圍第 1、2、3、4、5、6、7、8、9、10、11 或 12 項中任一項所述之化合物，其中  $X$  係 O。

14. 一種組成物，包含殺真菌有效量的、如申請專利範圍 1-13 中任一項所定義的具有化學式 (I) 之化合物。

15. 如申請專利範圍第 14 項所述之組成物，其中該組成物進一步包括至少一種另外的活性成分和/或稀釋劑。

16. 一種對抗、預防或控制致植物病的疾病之方法，該方法包括向植物病原體、植物病原體的場所、或易受植物病原體攻擊的植物、或其繁殖材

料施用殺真菌有效量的如在申請專利範圍 1-13 中任一項所定義的具有化學式 (I) 之化合物或包括殺真菌有效量的如在申請專利範圍 1-13 中任一項所定義的具有化學式 (I) 之化合物之組成物。