



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201036966 A1

(43)公開日：中華民國 99 (2010) 年 10 月 16 日

(21)申請案號：098141182

(22)申請日：中華民國 98 (2009) 年 12 月 02 日

(51)Int. Cl.：

C07D417/04 (2006.01)

C07D417/14 (2006.01)

A01N43/78 (2006.01)

A01N43/40 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

(30)優先權：2008/12/02 美國 61/119,137

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

(72)發明人：派斯特瑞 羅伯特 詹姆士 PASTERIS, ROBERT JAMES (US)

(74)代理人：黃章典

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：14 項 圖式數：0 共 529 頁

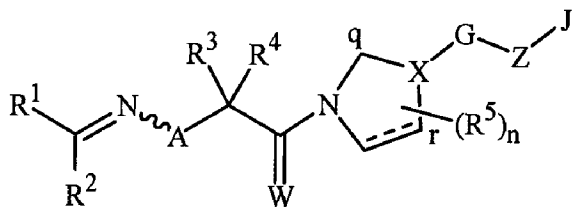
(54)名稱

殺真菌雜環化合物

FUNGICIDAL HETEROCYCLIC COMPOUNDS

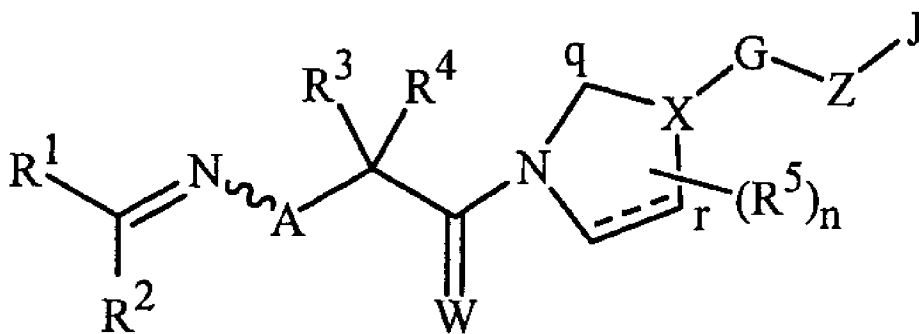
(57)摘要

本發明公開了式 1 化合物，包括其所有幾何和立體異構體、互變異構體、N-氧化物以及其鹽，



1

其中 R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、A、W、X、G、Z、J 和 n 是如本公開中所定義。本發明還公開了含有所述式 1 化合物的組合物和用於控制由真菌病原體引起的植物病害的方法，所述方法包括施用有效量的本發明化合物或組合物。



1



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公開本

(11)公開編號：TW 201036966 A1

(43)公開日：中華民國 99 (2010) 年 10 月 16 日

(21)申請案號：098141182

(22)申請日：中華民國 98 (2009) 年 12 月 02 日

(51)Int. Cl.：

C07D417/04 (2006.01)

C07D417/14 (2006.01)

A01N43/78 (2006.01)

A01N43/40 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

(30)優先權：2008/12/02 美國 61/119,137

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

(72)發明人：派斯特瑞 羅伯特 詹姆士 PASTERIS, ROBERT JAMES (US)

(74)代理人：黃章典

申請實體審查：無 申請專利範圍項數：14 項 圖式數：0 共 529 頁

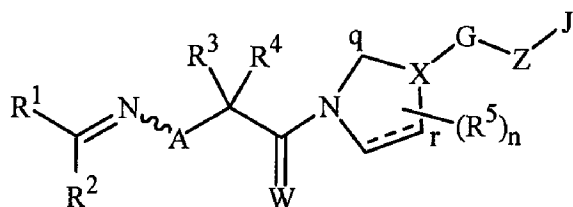
(54)名稱

殺真菌雜環化合物

FUNGICIDAL HETEROCYCLIC COMPOUNDS

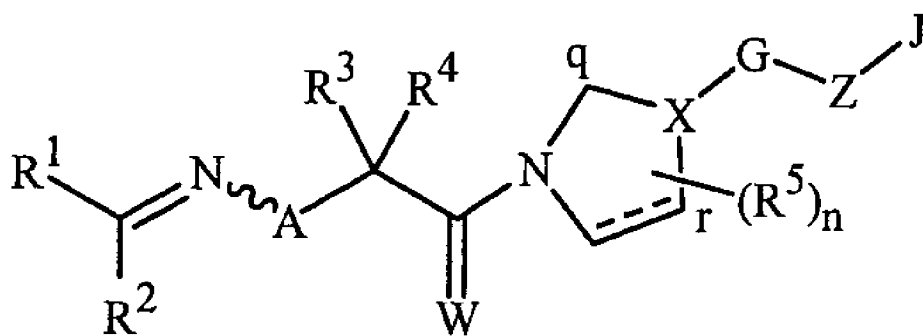
(57)摘要

本發明公開了式 1 化合物，包括其所有幾何和立體異構體、互變異構體、N-氧化物以及其鹽，



1

其中 R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、A、W、X、G、Z、J 和 n 是如本公開中所定義。本發明還公開了含有所述式 1 化合物的組合物和用於控制由真菌病原體引起的植物病害的方法，所述方法包括施用有效量的本發明化合物或組合物。



1

六、發明說明：

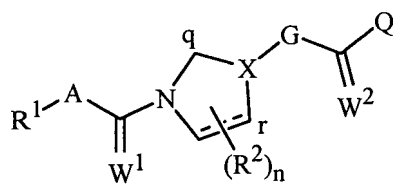
【發明所屬之技術領域】

本發明涉及某些雜環化合物，它們的互變異構體、
N-氧化物、鹽和組合物，以及將它們用作殺真菌劑的方法。

【先前技術】

控制由真菌植物病原體引起的植物病害對於獲得
高產量的農作物而言非常重要。植物病害損傷觀賞植
物、蔬菜、田間作物、穀類和水果作物，會引起明顯的
產量下降，從而導致消費者的費用增加。用於這些目的
的很多產品可商業獲得，但是還需要更有效、更低花
費、更低毒性、對環境更安全或具有不同作用位點的新
型化合物。

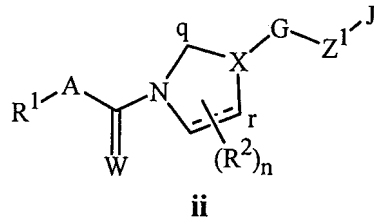
PCT 專利公開申請案第 WO 2007/014290 號揭露了
式 i 甲醯胺衍生物



i

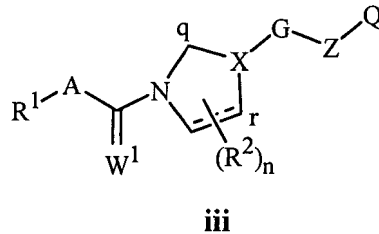
及其作為殺真菌劑的用途。

PCT 專利公開申請案第 WO 2008/013925 號揭露了
作為殺真菌劑的式 ii 偶氮環醯胺，



及其作為殺真菌劑的用途。

5 PCT 世界專利公開申請案第 WO 2008/091580 號公開了作為殺真菌劑的式 iii 醯胺衍生物，

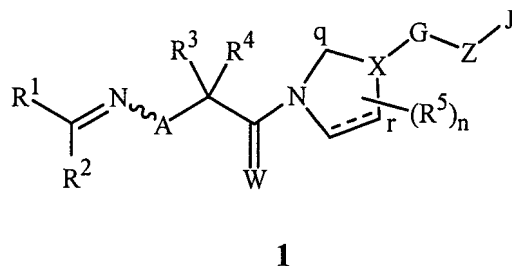


10 及其作為殺真菌劑的用途。

【發明內容】

本發明涉及式 1 化合物（包括所有幾何異構體和立體異構體）、它們的互變異構體、*N*-氧化物和其鹽，含有它們的農用組合物以及它們作為殺菌劑的用途：

15



其中

A 為 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(R^7)-$ 、 $-C(R^8)_2-$ 、 $-OC(R^8)_2-$ 、 $-SC(R^8)_2-$ 或 $-N(R^7)C(R^8)_2-$ ，

5 其中向左伸出的鍵連接至式 1 的氮原子，而向右伸出的鍵連接至式 1 的碳原子；

W 為 O 或 S；

G 為經任選取代的 5 員雜環；

Z 為直接鍵、O、 $C(=O)$ 、 $S(=O)_m$ 、 $CH(R^{12})$ 或 $N(R^{13})$ ；

10 J 是 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選

15 自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而矽原子環員獨立選自 SiR^9R^{10} ，每個環或環系統任選經最多 5 個獨立選自 R^6 的取代基取代；或者

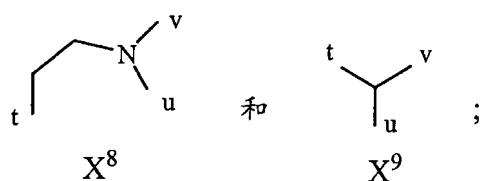
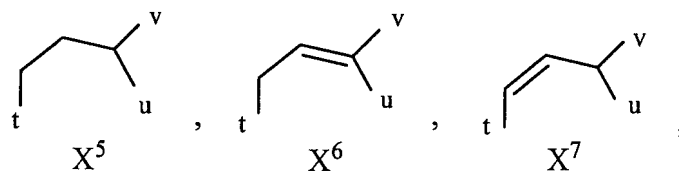
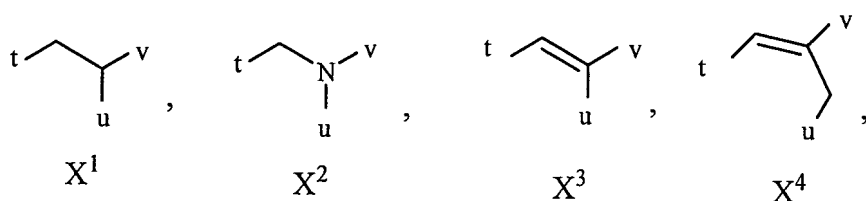
當 Z 為直接鍵時，則 J 也為 $C(=W^2)NT^AT^B$ ；

20 W^2 為 O 或 S；

T^A 為 H 或 C_1-C_3 烷基；

T^B 為 $CR^{14}R^{15}R^{16}$ ；

X 為選自如下的基團：



5

其中 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 X^7 、 X^8 或 X^9 的用「t」標識的鍵連接至式 1 的用「q」標識的碳原子，用「u」標識的鍵連接至式 1 的用「r」標識的碳原子，而用「v」標識的鍵則連接至式 1 的 G；

10

R^1 為 H、鹵素、氰基、胺基、-CHO、-C(=O)OH、-C(=O)NH₂、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基、C₂-C₆ 炔基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₂-C₆ 鹵烯基、C₂-C₆ 鹵炔基、C₃-C₆ 環烷基、C₃-C₆ 鹵環烷基、C₄-C₆ 烷基環烷基、C₄-C₆ 環烷基烷基、C₄-C₆ 鹵環烷基烷基、C₃-C₆ 環烯基、C₃-C₆ 鹵環烯基、C₂-C₆ 烷氧基烷基、C₂-C₆ 烷硫基烷基、C₂-C₆ 烷基亞磺醯基烷基、C₂-C₆ 烷基磺醯基烷基、C₂-C₆ 烷基胺基烷基、C₃-C₆ 二烷基胺基烷基、C₂-C₆ 鹵烷基胺基

20

烷基、C₂-C₆ 烷基羰基、C₂-C₆ 鹵烷基羰基、C₄-C₆
 環烷基羰基、C₂-C₆ 烷氧基羰基、C₄-C₆ 環烷氧
 基羰基、C₅-C₆ 環烷基烷氧基羰基、C₂-C₆ 烷基
 5 胺基羰基、C₃-C₆ 二烷基胺基羰基、C₁-C₆ 烷氧
 基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、C₃-C₆ 環烷氧基、C₃-C₆
 鹵環烷氧基、C₂-C₆ 烯氧基、C₂-C₆ 鹵烯氧基、
 C₂-C₆ 炔氧基、C₃-C₆ 鹵炔氧基、C₂-C₆ 烷氧基烷
 氧基、C₂-C₆ 烷基羰基氧基、C₂-C₆ 鹵烷基羰基
 氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 鹵烷硫基、C₃-C₆
 10 環烷硫基、C₁-C₆ 烷基胺基、C₂-C₆ 二烷基胺基、
 C₁-C₆ 鹵烷基胺基、C₂-C₆ 鹵二烷基胺基、C₃-C₆
 環烷基胺基、C₂-C₆ 烷基羰基胺基、C₂-C₆ 鹵烷
 基羰基胺基、C₁-C₆ 烷基磺醯基胺基或 C₁-C₆ 鹵
 烷基磺醯基胺基；

15 R² 是 H、鹵素、氰基、羥基、C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 鹵
 烷基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基或 C₁-C₃
 烷硫基；或者

20 R¹ 和 R² 與它們連接的碳原子一起形成 3-至 7-員
 環，該環含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的
 環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多
 2 個 S、最多 2 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中
 最多 3 個碳原子環員獨立選自 C(=O)和 C(=S)，
 硫原子環員獨立選自 S(=O)_s(=NR¹¹)_f 而矽原子
 環員獨立選自 SiR⁹R¹⁰，該環任選經最多 4 個獨
 25 立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、C₁-C₂ 烷
 基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₁-C₂ 烷氧基和 C₁-C₂ 鹵烷

氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和
 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

R^3 為經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任
 選取代的 5-至 6-員雜芳環；或 H、鹵素、氰基、
 5 羥基、-CHO、 C_1-C_4 烷基、 C_2-C_4 烯基、 C_2-C_4
 炔基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4 鹵烯基、 C_2-C_4 鹵炔
 基、 C_2-C_4 烷氧基烷基、 C_2-C_4 烷硫基烷基、 C_2-C_4
 烷基亞磺醯基烷基、 C_2-C_4 烷基磺醯基烷基、
 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 鹵烷基羰基、 C_2-C_5 烷氧
 10 基羰基、 C_2-C_5 烷基胺基羰基、 C_3-C_5 二烷基胺
 基羰基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4
 烷硫基、 C_1-C_4 鹵烷硫基、 C_1-C_4 烷基亞磺醯基、
 C_1-C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 烷基磺醯基、
 C_1-C_4 鹵烷基磺醯基、 C_2-C_4 烷基羰基氧基、
 15 C_2-C_4 鹵烷基羰基氧基、 C_2-C_5 烷氧基羰基氧
 基、 C_2-C_5 烷基胺基羰基氧基或 C_3-C_5 二烷基胺
 基羰基氧基；

R^4 為 H、 C_1-C_3 烷基或 C_1-C_3 鹵烷基；或者

R^3 和 R^4 與它們連接的碳原子一起形成 3-至 6-員飽
 20 和碳環；

每個 R^5 獨立地是鹵素、氰基、羥基、 C_1-C_4 烷基、
 C_1-C_4 烯基、 C_1-C_4 鹵烷基或 C_1-C_4 烷氧基；或
 者

兩個 R^5 基團合在一起為 C_1-C_4 伸烷基或 C_2-C_4 伸烯
 25 基，以形成橋聯雙環系統或稠合的雙環系統；
 或者

與由雙鍵接合的相鄰環碳原子連接的兩個 R^5 基團
 合在一起為 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ ，該
 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ 任選經最多 3 個獨立選自鹵
 素、氰基、羥基、胺基、硝基、 C_1-C_4 烷基、
 C_1-C_4 鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 鹵烷氧基
 的取代基取代；

每個 R^6 獨立地為 H、鹵素、氰基、羥基、胺基、硝
 基、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ 、 C_1-C_6 烷
 基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_1-C_6 鹵烷基、
 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵炔基、 C_3-C_8 環烷基、
 C_3-C_8 鹵環烷基、 C_4-C_{10} 烷基環烷基、 C_4-C_{10} 環
 烷基烷基、 C_6-C_{14} 環烷基環烷基、 C_4-C_{10} 鹵環
 烷基烷基、 C_5-C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_3-C_8 環烯
 基、 C_3-C_8 鹵環烯基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 C_4-C_{10}
 環烷氧基烷基、 C_3-C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2-C_6
 烷硫基烷基、 C_2-C_6 烷基亞磺醯基烷基、 C_2-C_6
 烷基磺醯基烷基、 C_2-C_6 烷基胺基烷基、 C_3-C_8
 二烷基胺基烷基、 C_2-C_6 鹵烷基胺基烷基、 C_4-C_{10}
 環烷基胺基烷基、 C_2-C_6 烷基羰基、 C_2-C_6 鹵烷
 基羰基、 C_4-C_8 環烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、
 C_4-C_8 環烷氧基羰基、 C_5-C_{10} 環烷基烷氧基羰
 基、 C_2-C_6 烷基胺基羰基、 C_3-C_8 二烷基胺基羰
 基、 C_4-C_8 環烷基胺基羰基、 C_2-C_6 鹵烷氧基烷
 基、 C_1-C_6 羥烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧
 基、 C_3-C_8 環烷氧基、 C_3-C_8 鹵環烷氧基、 C_4-C_{10}
 環烷基烷氧基、 C_2-C_6 烯氧基、 C_2-C_6 鹵烯氧基、

C_2-C_6 炔氧基、 C_2-C_6 鹵炔氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷
 氧基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 鹵烷基羰基
 氧基、 C_4-C_8 環烷基羰基氧基、 C_3-C_6 烷基羰基
 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 鹵烷硫基、 C_3-C_8
 5 環烷硫基、 C_1-C_6 烷基亞磺醯基、 C_1-C_6 鹵烷基
 亞磺醯基、 C_1-C_6 烷基磺醯基、 C_1-C_6 鹵烷基磺
 醯基、 C_3-C_8 環烷基磺醯基、 C_3-C_{10} 三烷基矽烷
 基、 C_1-C_6 烷基磺醯基胺基、 C_1-C_6 鹵烷基磺醯
 基胺基、 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；

10 每個 Z^2 獨立地是直接鍵、 O 、 $C(=O)$ 、 $S(O)_m$ 、 $CH(R^{12})$
 或 $N(R^{13})$ ；

15 每個 Q 獨立地為苯基、苄基、萘基、5-至 6-員雜芳
 環或 8-至 11-員雜芳族雙環系統，各任選經最
 多 2 個獨立選自碳和氮原子環員上的 R^{6b} 的取
 代基取代，並且各任選經最多 5 個獨立選自碳
 原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的 C_1-C_3 烷
 基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 烷氧基羰基或 C_1-C_3
 烷氧基的取代基取代；或者

20 3-至 7-員非芳族碳環、5-至 7-員非芳族雜環或
 8-至 11-員非芳族雙環系統，每個環或環系統含
 有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述
 雜原子獨立選自最多 2 個 O 、最多 2 個 S 、最
 多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳
 25 原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，硫原子環員
 獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而矽原子環員獨立選
 自 SiR^9R^{10} ，每個環或環系統的碳和氮原子環員

任選經最多 2 個獨立選自 R^{6b} 的取代基取代，最多 5 個獨立選自碳原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 烷氧基羰基和 C_1-C_3 烷氧基的取代基；

5 每個 R^{6a} 獨立地是鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_4-C_{10} 環烷基烷基、 C_4-C_{10} 烷基環烷基、 C_5-C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_6-C_{14} 環烷基環烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵炔基、 C_3-C_6 鹵環烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 鹵烷硫基、 C_1-C_4 烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 烷基磺醯基、 C_1-C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 鹵烷基磺醯基、 C_1-C_4 烷基胺基、 C_2-C_8 二烷基胺基、 C_3-C_6 環烷基胺基、 C_2-C_4 烷氧基烷基、 C_1-C_4 羥烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 烷基羰基硫基、 C_2-C_6 烷基胺基羰基、 C_3-C_8 二烷基胺基羰基或 C_3-C_6 三烷基矽烷基；或

20 R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成 5-至 7-員環，該環含有選自碳原子和任選最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

25

每個 R^{6b} 獨立地為任選經最多 3 個獨立選自如下的
 取代基取代的苯基：鹵素、氰基、 C_1-C_2 烷基、
 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基；
 或

5 5-至 6-員雜芳環，該雜芳環含有選自碳原子和
 最多 4 個獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和
 最多 4 個 N 原子的雜原子的環員，該環任選經
 最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰
 基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基和
 10 C_1-C_2 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2
 烷基和 C_1-C_2 烷氧基；或

3-至 7-員非芳族環，該環含有選自如下的環
 員：碳原子和最多 4 個獨立選自最多 2 個 O、
 最多 2 個 S 和最多 4 個 N 原子的雜原子，其中
 15 最多 3 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，
 該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的
 鹵素、氰基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2
 烷氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基和氮環原子上的氰
 基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

20 R^7 是 H、氰基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4
 烷氧基烷基、 C_2-C_4 烷硫基烷基、 C_2-C_4 烷基羰
 基、 C_2-C_4 鹵烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_4
 烷基胺基羰基、 C_3-C_5 二烷基胺基羰基、 C_1-C_4
 烷基磺醯基或 C_1-C_4 鹵烷基磺醯基；或者

25 R^2 和 R^7 與它們連接的連接原子一起形成 5-至 7-員
 部分不飽和環，除了連接原子外，該環還含有

選自如下的環員：碳原子和最多 3 個獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子的雜原子，該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員的鹵素、氰基、硝基、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₁-C₂ 烷氧基和 C₁-C₂ 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 烷氧基的取代基取代；

每個 R⁸ 獨立地為 H、C₁-C₃ 烷基或 C₁-C₃ 鹵烷基；

每個 R⁹ 和 R¹⁰ 獨立地為 C₁-C₅ 烷基、C₂-C₅ 烯基、C₂-C₅ 炔基、C₃-C₅ 環烷基、C₃-C₆ 鹵環烷基、C₄-C₁₀ 環烷基烷基、C₄-C₇ 烷基環烷基、C₅-C₇ 烷基環烷基烷基、C₁-C₅ 鹵烷基、C₁-C₅ 烷氧基或 C₁-C₅ 鹵烷氧基；

每個 R¹¹ 獨立地是 H、氰基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₃-C₈ 環烷基、C₃-C₈ 鹵環烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、C₁-C₆ 烷基胺基、C₂-C₈ 二烷基胺基、C₁-C₆ 鹵烷基胺基或苯基；

每個 R¹² 獨立地是 H、C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 鹵烷基；

每個 R¹³ 獨立地是 H、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 鹵烷基、C₃-C₆ 環烷基、C₂-C₄ 烷基羰基、C₂-C₄ 鹵烷基羰基、C₂-C₄ 烷氧基羰基或 C₂-C₄ 鹵烷氧基羰基；

R¹⁴ 為 H 或 C₁-C₄ 烷基；

R¹⁵ 為苯基、苄基、萘基或 5-至 6-員雜芳環，各在環員上任選經最多 3 個獨立選自 R¹⁹ 的取代基取代；

R^{16} 為 H、氰基、硝基、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基或
 C_2 - C_6 炔基；

每個 R^{17} 獨立地是 H、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、
 C_3 - C_8 環烷基、 C_2 - C_6 烷基羰基、 C_2 - C_6 鹵烷基
5 羰基、 C_2 - C_6 烷氧基羰基或 C_2 - C_6 鹵烷氧基羰
基；

每個 R^{18} 獨立地為 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_3 - C_8
環烷基、 C_2 - C_6 烷基羰基、 C_2 - C_6 鹵烷基羰基、
 C_2 - C_6 烷氧基羰基、 C_2 - C_6 鹵烷氧基羰基或
10 $-Z^3Q$ ；

每個 R^{19} 獨立地為鹵素、氰基、羥基、 C_1 - C_3 烷基、
 C_1 - C_3 鹵烷基或 C_1 - C_3 烷氧基；或者

R^{16} 和 R^{19} 與它們連接至的原子一起形成 3-至 7-員
環，該環含有選自如下的環員：碳原子和最多
15 4 個獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多
2 個 N 和最多 2 個 Si 原子的雜原子，其中最
多 2 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，
硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而矽原
子環員獨立選自 SiR^9R^{10} ，該環任選經最多 4
20 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、羥
基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基和氮原子環員
上的氰基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基的取代
基取代；

每個 Z^3 獨立地為 O、 $C(=O)$ 、 $S(=O)_m$ 或 $CH(R^{12})$ ；

每個 m 獨立地為 0、1 或 2；

n 為 0、1 或 2；並且

s 和 f 在每種 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ 的情況下都獨立地為 0、1 或 2，前提條件是 s 與 f 之和為 0、1 或 2。

更具體地講，本發明涉及式 1 化合物（包括所有幾何異構體和立體異構體）、它們的互變異構體、N-氧化物或鹽。

本發明還涉及一種殺真菌組合物，其包含(a)式 1 之化合物；和(b)至少一種額外組分，所述額外組分選自表面活性劑、固體稀釋劑和液體稀釋劑。

本發明還涉及一種殺真菌組合物，其包含(a)式 1 化合物；和(b)至少一種其他殺真菌劑（例如，至少一種具有不同作用位點的其他殺真菌劑）。

本發明還涉及用於控制由真菌植物病原體引起的植物病害的方法，包括向植物或其部分或者向植物種子施用殺真菌有效量的本發明化合物（例如，本文所述的組合物）。

【實施方式】

如本文所用，術語「包含」、「包含有」、「包括」、「包括有」、「有」、「具有」、「含」或「含有」、「其特徵在於」或其任何其他變型形式都旨在涵蓋非排它性的包括，但亦受到任何明示指出之限定。例如，包括一系列元素的組合物、混合物、製程或方法並不一定僅受限於那些元素，而是可包括未針對這類組合物、混合物、製程或方法明確列出的或這類組合物、混合物、製程或方法所固有的其他組成元素。

5 連接詞「由……所組成」排除任何未指定之元件、
步驟或成分。若在申請專利範圍中使用此連接詞，則此
會使該申請專利範圍限定在包括所述的材料，除了平常
與其相關的雜質。當該連接詞「由……所組成」出現在
一申請專利範圍之主體的子句中，而非直接接在前言之
後時，其僅限定子句中所述之元件，其他元件非排除於
該申請專利範圍作為一整體之外。

10 連接詞「基本上由……所組成」係用以定義一組成
物或方法，該組成物或方法包括明文所述者以外之材
料、步驟、特徵、組分或元件，倘若這些額外之材料、
步驟、特徵、組分或元件不會實質上影響該所主張之發
明的基本與新穎特徵。

15 在申請人以一開放性術語如「包含」來定義一發明
或其一部分時，應立即瞭解到（除非另有說明）應將該
描述解讀為亦使用術語「基本上由……所組成」或
「由……所組成」來描述此一發明。

20 而且，除非明確說明與此相反，否則「或」指包涵
性的或並且不是指排他性的或。例如，下面任一種情況
均滿足條件 A 或 B：A 為真（或存在）而 B 是假（或不
存在）、A 為假（或不存在）而 B 為真（或存在），以及
A 和 B 均為真（或存在）。

25 另外，在本發明的元素或組分前面的不定冠詞「一
個」和「一種」旨在表示就元素或組分的實例（即出現）
數目而言是非限制性的。因此，「一個」或「一種」應
該理解為包括一種或至少一種，並且元素或組分的單數
形式也包含複數的意思，除非數值明顯地表示為單數。

如本發明和申請專利範圍所提及的，「植物」包括處於所有生命階段的植物界成員，特別是種子植物（Spermatopsida），包括幼株（例如，發育成籽苗的萌發種子）和成熟、生殖階段的植株（例如長出花和種子的植株）。植物的部分包括通常生長在生長介質（如土壤）表面以下的向地性部分，例如根、塊莖、鱗莖和球莖，而且還包括生長在生長介質之上的部分，例如葉（包括葉柄和葉）、花、果實和種子。

如本文所提及的，單獨使用的或在組合詞中使用的術語「籽苗」表示由種子的胚發育而來的幼株或無性繁殖單元如塊莖、球莖或根狀莖的芽。

在上面的敘述中，單獨使用的或在複合詞如「烷硫基」或「鹵烷基」中使用的術語「烷基」包括直鏈與支鏈的烷基，例如甲基、乙基、正丙基、異-丙基以及不同的丁基、戊基與己基異構體。「烯基」包括直鏈與支鏈的烯烴，例如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基以及不同的丁烯基、戊烯基和己烯基異構體。「烯基」還包括多烯烴例如 1,2-丙二烯基和 2,4-己二烯基。「炔基」包括直鏈與支鏈的炔烴例如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基和不同的丁炔基、戊炔基和己炔基異構體。「炔基」還可包括由多個三鍵組成的部分，例如 2,5-己二炔基。「伸烷基」表示直鏈或支鏈的烷二基。「伸烷基」的例子包括 CH_2 、 CH_2CH_2 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ 和不同的丁烯異構體。「伸烯基」表示直鏈或支鏈的含一個烯鍵的烯二基。「伸烯基」的例子包括 $\text{CH}=\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$ 與 $\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)$ 。

「烷氧基」包括（例如）甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基和不同的丁氧基、戊氧基和己氧基異構體。「烯氧基」包括直鏈與支鏈的連接至氧原子的烯基和通過氧原子相連的烯基。「烯氧基」的例子包括

5 $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 與 $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 。

「炔氧基」包括直鏈與支鏈的炔氧基部分。「炔氧基」的例子包括 $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ 、 $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ 和 $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 。術語「烷硫基」包括直鏈與支鏈的

烷硫基部分，例如甲硫基、乙硫基和不同的丙硫基、丁硫基、戊硫基和己硫基異構體。「烷基亞磺醯基」包括

10 烷基亞磺醯基的兩種鏡像異構物。「烷基亞磺醯基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})$ 、

$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(=\text{O})$ 以及不同的丁基亞磺醯基、戊基亞磺醯基和己基亞磺醯基異構體。「烷基磺醯基」

15 的例子包括 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(=\text{O})_2$ ，以及不同的丁基磺醯基、戊基磺醯基和己基磺醯基異構體。「烷基胺基」

包括被直鏈或支鏈烷基團取代的 NH 基。「烷基胺基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NH}$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}$ 和

20 $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}_2\text{NH}$ 。「二烷基胺基」的例子包括 $(\text{CH}_3)_2\text{N}$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2)_2\text{N}$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{N}$ 。

「烷基羰基」表示直鏈或支鏈結合至 $\text{C}(=\text{O})$ 部分的烷基。「烷基羰基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})$ 。「烷氧基羰基」

25 的例子包括 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$ 以及不同的丁氧

基與戊氧基羰基異構體。「烷基胺基羰基」的例子包括
 $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ 、
 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(=\text{O})$ 以及不同的丁
 基胺基與戊基胺基羰基異構體。「二烷基胺基胺基羰基」
 的例子包括 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(=\text{O})$ 、
 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ 與
 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ 。

「烷氧基烷基」表示烷基上的烷氧基取代。「烷氧
 基烷基」的例子包括 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、
 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 和
 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 。「烷氧基烷氧基」表示另一個烷氧基
 部分上的烷氧基取代。「烷氧基烷氧基烷基」表示烷基
 上的烷氧基烷氧基取代。「烷氧基烷氧基烷基」的例子
 包括 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 和
 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{OCH}_2$ 。

「烷硫基烷基」表示烷基上的烷硫基取代。「烷硫
 基烷基」的例子包括 CH_3SCH_2 、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、
 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 和
 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ ；「烷基亞磺醯基烷基」和「烷基磺醯
 基烷基」分別包括對應的亞磺和磺。「烷基羰基硫基」表
 示直鏈或支鏈的連接至硫原子和通過硫原子相連的烷
 基羰基。「烷基羰基硫基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{S}$ 、
 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{S}$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})\text{S}$ 。

「烷基胺基烷基」表示烷基上的烷基胺基取代。「烷
 基胺基烷基」的例子包括 CH_3NHCH_2 、 $\text{CH}_3\text{NHCH}_2\text{CH}_2$ 、
 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_2$ 和

$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_2$ 。「二烷基胺基烷基」的例子包括 $((\text{CH}_3)_2\text{CH})_2\text{NCH}_2$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2)_2\text{NCH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NCH}_2\text{CH}_2$ 。

術語「烷基羰基胺基」表示與 $\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ 部分鍵合的烷基。「烷基羰基胺基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ 。「烷基磺醯基胺基」表示被烷基磺醯基取代的 NH 基。「烷基磺醯基胺基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2\text{NH}$ 與 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(=\text{O})_2\text{NH}$ 。

術語「烷基羰基氧基」表示一直鏈或支鏈的與 $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ 部分鍵合的烷基。「烷基羰基氧基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{O}$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})\text{O}$ 。術語「烷基羰基烷氧基」表示與烷氧基部分鍵合的烷基羰基。「烷基羰基烷氧基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{O}$ 。「烷氧基羰基氧基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{O}$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})\text{O}$ 。

術語「烷基胺基羰基氧基」表示一直鏈或支鏈的連接至氧原子和通過氧原子相連的烷基胺基羰基。「烷基胺基羰基氧基」的例子包括 $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}_2\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ 。「二烷基胺基羰基氧基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})\text{O}$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})\text{O}$ 。

「環烷基」包括（例如）環丙基、環丁基、環戊基和環己基。術語「環烷基烷基」表示烷基部分上的環烷基取代。「環烷基烷基」的例子包括環丙基甲基、環戊基乙基，以及與一直鏈或支鏈烷基鍵合的其他環烷基部分。術語「烷基環烷基」表示環烷基部分上的烷基取代，並且包括（例如）乙基環丙基、異丙基環丁基、甲基環

戊基和甲基環己基。「環烯基」包括諸如環戊烯基和環己烯基之類的基團以及具有不止一個雙鍵的基團如1,3-或1,4-環己二烯基。

術語「環烷氧基」表示連接至氧原子和通過氧原子相連的環烷基，例如環戊氧基和環己氧基。術語「環烷硫基」表示連接至硫原子和通過硫原子相連的環烷基，例如環丙硫基和環戊硫基；「環烷基磺醯基」包括相應的磺。術語「環烷氧基烷基」表示烷基部分上的環烷氧基取代。「環烷氧基烷基」的例子包括環丙氧基甲基、環戊氧基乙基和其他與一直鏈或支鏈烷基部分鍵合的環烷氧基團。「環烷基烷氧基」表示烷氧基部分上的環烷基取代。「環烷基烷氧基」的例子包括環丙基甲氧基、環戊基乙氧基，以及其他與一直鏈或支鏈烷氧基部分鍵合的環烷基團。

「烷基環烷基烷基」表示被烷基環烷基取代的烷基。「烷基環烷基烷基」的例子包括甲基環己基甲基或乙基環己基甲基。術語「環烷基環烷基」表示另一個環烷基環上的環烷基取代，其中每個環烷基環獨立地具有3至7個碳原子環員。環烷基環烷基的例子包括環丙基環丙基（例如1,1'-二環丙基-1-基、1,1'-二環丙基-2-基）、環己基環戊基（例如4-環戊基環己基）和環己基環己基（例如1,1'-二環己基-1-基），以及不同的順式-和反式-環烷基環烷基異構體（例如(1*R*,2*S*)-1,1'-二環丙基-2-基和(1*R*,2*R*)-1,1'-二環丙基-2-基）。

「環烷基胺基」表示被環烷基取代的NH基。「環烷基胺基」的例子包括環丙基胺基和環己基胺基。術語

「環烷基胺基烷基」表示烷基上的環烷基胺基取代。「環烷基胺基烷基」的例子包括環丙基胺基甲基、環戊基胺基乙基，以及其他與一直鏈或支鏈烷基鍵合的環烷基胺基部分。

5 「環烷基羰基」表示與 C(=O)基團鍵合的環烷基，包括（例如）環丙基羰基和環戊基羰基。術語「環烷氧基羰基」表示與 C(=O)基團鍵合的環烷氧基，例如環丙氧基羰基和環戊氧基羰基。「環烷基胺基羰基」表示與 C(=O)基團鍵合的環烷基胺基，例如環戊基胺基羰基和環己基胺基羰基。「環烷基烷氧基羰基」表示與 C(=O)基團鍵合的環烷基烷氧基。「環烷基烷氧基羰基」的例子包括環丙基乙氧基羰基和環戊基甲氧基羰基。「環烷基羰基氧基」表示連接至氧原子和通過氧原子相連的環烷基羰基。「環烷基羰基氧基」的例子包括環己基羰基氧基和環戊基羰基氧基。

10

15

單獨使用或在複合詞如「鹵烷基」中使用，或在諸如「鹵素取代的烷基」之類的描述中使用時，術語「鹵素」均包括氟、氯、溴或碘。而且，當在複合詞如「鹵烷基」中使用時，或者在諸如「鹵素取代的烷基」之類的描述中使用時，所述烷基可用相同或不同的鹵素原子部分取代或完全取代。「鹵烷基」或「鹵素取代的烷基」的例子包括 F_3C 、 $ClCH_2$ 、 CF_3CH_2 和 CF_3CCl_2 。術語「鹵烯基」、「鹵炔基」、「鹵烷氧基」、「鹵烷硫基」、「鹵烷基胺基」、「鹵烷基亞磺醯基」、「鹵烷基磺醯基」、「鹵環烷基」等與術語「鹵烷基」的定義類似。「鹵烯基」的例子包括 $(Cl)_2C=CHCH_2$ 和 $CF_3CH_2CH=CHCH_2$ 。「鹵炔基」

20

25

的例子包括 $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$ 、 $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$ 和 $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ 。「鹵烷氧基」的例子包括 CF_3O 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ 、 $\text{F}_2\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 和 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ 。「鹵烷硫基」的例子包括 CCl_3S 、 CF_3S 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$ 和 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$ 。「鹵烷基胺基」的例子包括 $\text{CF}_3(\text{CH}_3)\text{CHNH}$ 、 $(\text{CF}_3)_2\text{CHNH}$ 和 $\text{CH}_2\text{ClCH}_2\text{NH}$ 。「鹵烷基亞磺基」的例子包括 $\text{CF}_3\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})$ 和 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(=\text{O})$ 。「鹵烷基磺基」的例子包括 $\text{CF}_3\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2$ 和 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(=\text{O})_2$ 。「鹵環烷基」的例子包括 2-氯環丙基、2-氟環丁基、3-溴環戊基和 4-氯環己基。單獨使用或在複合詞如「鹵二烷基胺基」中使用的術語「鹵二烷基」表示兩個烷基中的至少一者用至少一種鹵素原子取代，並且獨立的是各個鹵化烷基可用相同或不同的鹵素原子部分取代或完全取代。「鹵二烷基胺基」的例子包括 $(\text{BrCH}_2\text{CH}_2)_2\text{N}$ 和 $\text{BrCH}_2\text{CH}_2(\text{ClCH}_2\text{CH}_2)\text{N}$ 。

「羥基烷基」表示一被一羥基團取代之烷基。「羥基烷基」的例子包括 HOCH_2CH_2 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{OH})\text{CH}$ 與 $\text{HOCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 。

「三烷基矽烷基」包括 3 個連結且聯接於一矽原子的支鏈與／或直鏈烷基，例如三甲基矽烷基、三乙基矽烷基與三級丁基二甲基矽烷基。

在一取代基團中的碳原子總數係由「 $\text{C}_i\text{-C}_j$ 」前綴指示，其中 i 與 j 係為由 1 至 14 的數字。例如， $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基磺基表示甲基磺基至乙基磺基； C_2 烷氧基表示 CH_3OCH_2 ； C_3 烷氧基表示如

$\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 或 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ ；以及 C_4 烷氧基烷基表示一經一烷氧基團取代之烷基團的各式異構體，該烷氧基團含有總共四個碳原子，例子包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 與 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 。

5 術語「未取代」在與一基團如一環或環系統連結使用時，係指該基團在其一或多個連結處外不具有任何取代基在該式 1 的剩餘位置上。術語「任選經取代」係指
 10 取代基的數目可以為零。除非另有指明，任選經取代的基團可被許多任選的取代基取代，只要該藉由用一非氫
 15 取代基在任何可得的碳或氮原子上替換一氫原子的取代仍可配合。通常該任選取代基（若存在時）的數字介於由 1 至 4。如本文中所用，術語「任選經取代」係可與片語「取代或未取代」或術語「(未)取代」互換使用。當一基團（例如 J）含有一可為氫的取代基（例如 R^6 ）時，那麼當此取代基係為氫時，可理解為此係等同於該基團係為未取代的。

20 該任選取代基的數目可用明示的限定加以限制。例如，該片語「任選經最多 3 個獨立選自 R^6 的取代基」係指 0、1、2 或 3 個取代基可以存在（若該潛在連結點的數目許可時）。同樣地，該片語「任選經最多 5 個獨立選自 R^6 的取代基」係指 0、1、2、3、4 或 5 個取代基可以存在，若該潛在連結點的數目許可時。當一由該取代基數目所指定的範圍（例如在示例 3 中，x 為由 1 至 5 的整數）超過在一環上可得的取代基位置數目時
 25 （例如在示例 3 中，J-1 上的 $(\text{R}^6)_x$ 有 2 個位置可得），該

範圍實際上較高的一端點應認知為該可得位置的數目)。

當一化合物經一帶有下標(其係指該取代基的數目可以改變,如在示例3中的 $(R^6)_x$,其中 x 為1至5)的取代基取代時,那麼該取代基係獨立選自該定義的取代基所組成的群組,除非另有指明。當一可變的基團係顯示為任選連接在一位置上時,例如在示例5中的 $(R^{6a})_p$,而其中 p 可為0,那麼氫可在該位置即使該可變基團的定義未敘明。

使用術語「任選經取代」但未敘明數目或指出可能的取代基(例如在 G 與 R^3 中環的定義)時,係指基團未經取代或具有至少一個非氫取代基,該取代基與該未取代類似物所擁有的生物活性無法區別。

本揭露中的取代基命名使用公認的命名法,而簡明並準確地傳達化學結構予熟悉該項技術者。為簡明起見,位標(locant)的描述符號可加以省略。

除非另外指明,否則作為式1組成部分的「環」或「環系統」(例如取代基 J 和 Q)是碳環或雜環。術語「環系統」表示兩個或更多個相連的環。術語「螺環系統」表示由兩個在單個原子處連接的環組成的環系統(因此該環具有單個共有原子)。示例性的為螺環系統的 J 部分是下文示例A中所示出的J-29-27。術語「雙環系統」表示由兩個具有兩個或更多個共有原子的環組成的環系統。在「稠合的雙環系統」中,共有原子是相鄰的,並因此所述環共有兩個相鄰的原子和連接它們的鍵。在「橋聯雙環系統」中,共有原子不相鄰(即橋頭

原子之間不存在鍵)。「橋聯雙環系統」可通過一種或多種原子的鏈段與環中不相鄰的環員鍵合而形成。

環、雙環系統或螺環系統可以是含有不止兩個環的擴展的環系統的部分，其中環、雙環系統或螺環系統上的取代基可以合在一起形成另外的環，該環與該擴展的環系統的其他環為雙環和/或螺環關係。例如，下文示例 A 中示出的 J 部分 J-29-30 由被一個 R^6 取代基(其為 $-Z^2Q$ ，其中 Z^2 為一 $-CH_2-$ 基團而 Q 為一經一 R^{6a} 取代基 ($-CH_2-$) 取代的苯環) 取代的二氫異噁唑啉環組成，其中該 R^{6a} 取代基與該二氫異噁唑啉環上的另一 R^6 取代基 ($-CH_2-$) 一起形成該環系統中的另外的六-員環。

術語「環員」指形成環或環系統的主鏈的原子(如 C、O、N 或 S) 或其他部分(如 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 SiR^9R^{10} 或 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$)。術語「芳族」表示每個環原子基本上在同一平面內並且具有垂直於環平面的 p -軌道，並且表示所述環具有 $(4n + 2)$ 個 π 電子(其中 n 為正整數) 以符合休克爾規則(Hückel's rule)。

術語「碳環」表示其中形成環主鏈的原子僅選自碳的環。除非另外指明，否則碳環可以是飽和的、部分不飽和的或完全不飽和的環。當完全不飽和的碳環滿足休克爾規則時，則所述環也稱為「芳族環」。「飽和碳環的」指其主鏈是由經單鍵彼此相連的碳原子組成的環；除非另外指明，否則剩餘的碳價由氫原子佔用。

如本文中所示，術語「部分不飽和環」或「部分不飽和雜環」係指含有不飽和環原子與一或多個非芳族雙鍵的環，例如一 4,5-二氫-1*H*-吡唑基-1-基環。

術語「雜合環」或「雜環」表示其中至少一個形成環主鏈的原子不是碳的環。除非另外指明，否則雜環可以是飽和的、部分飽和的或完全飽和的環。當完全飽和的雜環滿足休克爾規則時，所述環也稱為「雜芳環」或芳族雜環。「飽和雜環」指在環員之間僅含有單鍵的雜環。

除非另外指明，否則雜環和環系統經由任何可利用的碳或氮原子，通過置換所述碳或氮原子上的氫來連接至式 1 的其餘部分。

式 1 中和本發明所述的其他環中的虛線表示該鍵可以是單鍵或雙鍵。

氮原子和由式 1 中 A 所表示的原子之間的波狀鍵（和本發明所述的其他環中）指示一單鍵，並且指示鄰近雙鍵（即連接氮原子與 R^1 和 R^2 取代基的鍵）的幾何位置為順式-(*E*)、反式-(*Z*)或它們的組合。

如上所說明的，J（尤其）是 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 C(=O) 和 C(=S)，硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而矽原子環員獨立選自 SiR^9R^{10} ，每個環或環系統任選經最多 5 個獨立選自 R^6 的取代基取代。在該定義中，選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子的環員是可選的，因為雜原子環員數可以為零。當不存在雜原子環員時，該環或環系統是碳環的。如果存

在至少一個雜原子環員，則該環或環系統是雜環的。
 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ 的定義允許具有最多 2 個硫環員，其可以是氧化的硫部分（如 $S(=O)$ 或 $S(=O)_2$ ）或未氧化的硫原子（即 s 和 f 均為零時）。可以將氮原子環員氧化成 N -氧化物，因為與式 1 相關的化合物也包括 N -氧化物
 5 衍生物。選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ 的最多 3 個碳原子環員加在選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子的最多 4 個雜原子上。由於 R^6 取代基是可選的，所以可以存在 0 至 5 個取代基，這僅受限於在 J 上
 10 可用的連接點的數目。當取代基 R^6 為 H，則不計入為該 5 個取代基基中之一。矽原子環員上的取代基被獨立地定義為 R^9 和 R^{10} 。

如上文所說明的， R^1 和 R^2 可以與它們連接的碳原子一起形成 3-至 7-員環。該 3-至 7-員環包括取代基 R^1
 15 和 R^2 與之連接的作為環員的碳原子。其他 2 至 6 個環員原子選自碳原子和最多 4 個獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 2 個 N 和最多 2 個 Si 原子的雜原子。在該定義中，雜原子是可選的，因為雜原子環員的數目可以為零。當不存在雜原子環員時，該環是碳環的。如果存在至少一個雜原子環員，則該環是雜環的。該環可
 20 任選經最多 4 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基和 C_1 - C_2 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基的取代基取代。可以將氮原子環員氧化成 N -氧化物，
 25 因為與式 1 相關的化合物也包括 N -氧化物衍生物。

如上文所說明的，Q（尤其）是 3-至 7-員非芳族碳環、5-至 7-員非芳族雜環或 8-至 11-員雜芳族雙環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 C(=O)和 C(=S)，硫原子環員獨立選自 S(=O)_s(=NR¹¹)_f，而矽原子環員獨立選自 SiR⁹R¹⁰，每個環或環系統的碳和氮原子環員任選經最多 2 個獨立選自 R^{6b} 的取代基取代，最多 5 個獨立選自碳原子環員上的 R^{6a} 和選自氮原子環員上的 H、C₁-C₃ 烷基、C₂-C₃ 烷基羰基、C₂-C₃ 烷氧基羰基和 C₁-C₃ 烷氧基的取代基。在該定義中，選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子的環員是可選的，因為雜原子環員數可以為零。當不存在雜原子環員原子時，該環或環系統是碳環的。如果存在至少一個雜原子環員，該環或環系統是雜環的。S(=O)_s(=NR¹¹)_f 的定義允許具有最多 2 個硫環員，其可以是氧化的硫部分（如 S(=O)或 S(=O)₂）或未氧化的硫原子（即 s 和 f 均為零時）。可以將氮原子環員氧化成 N-氧化物，因為與式 1 相關的化合物也包括 N-氧化物衍生物。所述最多 3 個選自 C(=O)和 C(=S) 的碳原子環員加在所述最多 4 個選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子的雜原子上。

如上文所說明的，R⁶ 和 R^{6a} 可以與它們連接的原子一起形成 5-至 7-員環，其包括作為環員之：(a) 取代基 R⁶ 和 R^{6a} 直接連接的兩個原子、(b) J、Z² 和 Q 的居間（即其他連接的）原子，可以認為 R⁶ 和 R^{6a} 與該居間的原子

間接連接以及(c) R^6 和 R^{6a} 取代基。環的環員選自碳原子和可任選地最多 3 個獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子的雜原子。在該定義中，選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子的環員是可選的，
 5 因為雜原子環員數可以為零。該環在碳原子環員上任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代。這些任選的取代基（當存在時）連接至可用之碳原子環員和氮原子環員並連接在由 R^6 與 R^{6a} 所提供的環部分。

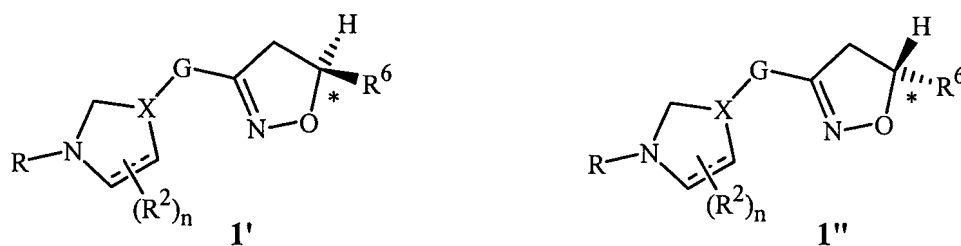
如上文所說明的， R^2 和 R^7 可以與它們所連接的連接原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環。該連接原子是 R^2 與之直接連接的碳原子、 R^7 與之直接連接的氮原子（只有當 A 為 $-N(R^7)-$ 時存在），以及式 1 中描述為「 $=N\sim$ 」
 15 的居間氮原子。因此，該 3 個連接原子為「 $-C=N\sim N(R^7)-$ 」。連接原子提供了 3 個 5-至 7-員環的環員。該環的其他 2 至 4 個環員由 R^2 和 R^7 取代基提供。這些其他的環員選自碳原子和最多 3 個獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子的雜原子。在該定義中，選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子的環員是可選的，因為雜原子環員數可以為零。該環可任選經最多 3 個獨立選自碳環員原子上的鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基和氮環員原子上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代。除了 R^1 和式 1 連接至該環的其餘部分外，這些可選的取代基（當存在時）連接至可用
 20
 25

的碳原子和氮原子環員並連接在由 R^2 與 R^7 所提供的環部分。可以將氮原子環員氧化成 *N*-氧化物，因為與式 1 相關的化合物也包括 *N*-氧化物衍生物。

如上文所說明的， R^{16} 和 R^{19} 可以與它們連接的原子一起形成 3-至 7-員環，其包括作為環員的：(a) 兩個與取代基 R^{16} 和 R^{19} 直接連接的原子、(b) 以及 R^{15} 的居間（即其他連接的）原子，可以認為 R^{16} 和 R^{19} 與該居間原子間接連接以及(c) R^{16} 和 R^{19} 取代基。環的環員選自碳原子和最多 4 個雜原子，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 2 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 2 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而矽原子環員獨立選自 SiR^9R^{10} ，該環任選經最多 4 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、羥基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基的取代基取代。在該定義中，選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 2 個 N 和最多 2 個 Si 原子的環員是可選的，因為雜原子環員數可以為零。 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ 的定義允許具有最多 2 個硫環員，其可以是氧化的硫部分（如 $S(=O)$ 或 $S(=O)_2$ ）或未氧化的硫原子（即 s 和 f 均為零時）。可以將氮原子環員氧化成 *N*-氧化物，因為與式 1 相關的化合物也包括 *N*-氧化物衍生物。選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ 的最多 2 個碳原子環員加在選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 2 個 N 和最多 2 個 Si 原子的最多 4 個雜原子上。這些任選的取代基（當存在時）連接至可用的碳原子和

氮原子環員並連接在由 R¹⁶ and R¹⁹ 所提供的環部分。矽原子環員上的取代基被分別定義為 R⁹ 和 R¹⁰。

式 1 化合物可以作為一種或多種立體異構體存在。多種立體異構體包括鏡像異構物、非鏡像異構物、阻轉異構體和幾何異構體。本領域技術人員將會知道，一種立體異構體在相對於其他立體異構體富集時或在與其他立體異構體分離時，可更具有活性和/或可顯示出有益效應。另外，技術人員知道如何去分離、富集和/或選擇性地製備所述立體異構體。式 1 化合物可以作為立體異構體的混合物、單種的立體異構體存在，或以旋光形式存在。例如，當 J 為在 3-位置鍵合至式 1 的其餘部分的 J-29 (參見示例 3) 並且 J-29 在 5-位置具有一個 R⁶ 取代基而不是 H 時，式 1 在與 R⁶ 鍵合的碳原子處具有一個手性中心。描述了如下式 1' 和式 1'' 兩種鏡像異構物並且其手性中心用星號(*)標識。



式 1 化合物包括外消旋的混合物，例如等量的式 1' 和式 1'' 鏡像異構物。另外，式 1 化合物還包括與外消旋混合物相比較富集有式 1 的鏡像異構物的化合物。另外還包括基本上純的式 1 化合物的鏡像異構物，例如式 1' 和式 1''。

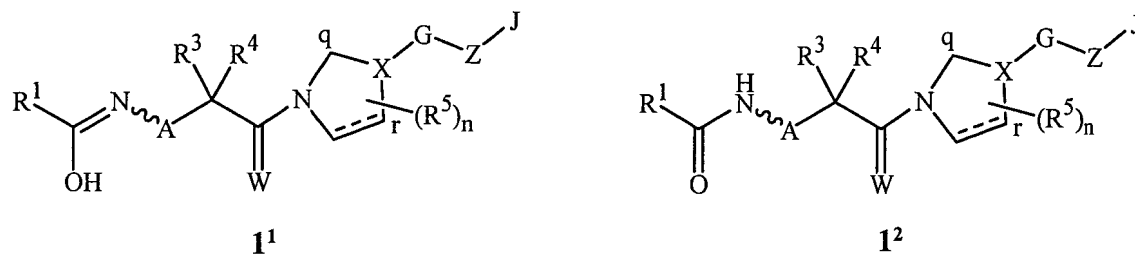
當富集鏡像異構物時，一種鏡像異構物會以大於其他鏡像異構物的量存在，並且富集程度可用鏡像異構物過量（「ee」）來限定，鏡像異構物過量被定義為 $(2x-1) \cdot 100\%$ ，其中 x 為混合物中佔優勢的鏡像異構物的莫耳分數（例如，ee 為 20% 對應於 60:40 的鏡像異構物比率）。

較佳地，本發明的式 1 組合物具有至少 50% 鏡像異構物過量；更佳至少 75% 鏡像異構物過量；更佳至少 90% 鏡像異構物過量；並且最佳至少 94% 鏡像異構物過量的更具活性的異構體。特別值得注意的是對映異構體純的更具活性的異構體的實施例。

式 1 化合物可具有另外的手性中心。例如，取代基和其他的分子組成如 A、 R^3 、 R^4 、 R^6 、 R^{6a} 、G、J、Q、 X^1 至 X^9 、Z、 Z^2 和 Z^3 可本身含有手性中心。在這些另外的手性中心處式 1 化合物包含外消旋混合物以及富集且基本上純的立體構型。

式 1 化合物可以因式 1 中醯胺鍵（如 $C(=W)-N$ ）的旋轉受限而作為一種或多種構象異構體存在。式 1 化合物包含構象異構體的混合物。像另外，式 1 化合物包括一種構象異構體相對於其他構象異構體富集的化合物。

本領域技術人員將認識到，式 1 化合物可與一種或多種它們各自的互變異構對應物平衡共存。除非另外指明，否則通過對一種互變異構體的描述來提及化合物可認為是包括所有互變異構體。例如，當式 1 中的 R^2 為羥基時，則提及式 1¹ 描述的互變異構形式還包括式 1² 描述的互變異構形式。



另外，在示例 1、2、3 和 4 中描述的某些不飽和的環和環系統可在環員之間具有與所描述的不同單鍵和雙鍵排列。這種針對特定環原子排列的不同鍵排列對應不同的互變異構體。對於這些不飽和的環和環系統而言，所描述的特定互變異構體被認為是代表對所示環原子的排列來說可能的所有互變異構體。

本發明的化合物包括式 1 的 *N*-氧化物衍生物。本領域技術人員將會知道，並不是所有含氮的雜環都可形成 *N*-氧化物，因為氮需要可用的孤電子對來氧化成氧化物；本領域技術人員將知道可形成 *N*-氧化物的那些含氮雜環。本領域技術人員還知道三級胺可形成 *N*-氧化物。用於製備雜環和三級胺的 *N*-氧化物的合成方法是本領域技術人員所熟知的，包括用如下物質氧化雜環和三級胺：過氧酸如過氧乙酸和間-氯過苯甲酸 (MCPBA)、過氧化氫、烷基氫過氧化物如三級-丁基氫過氧化物、過硼酸鈉和雙環氧乙烷如二甲基雙環氧乙烷。用於製備 *N*-氧化物的這些方法已在文獻中有充分描述和評論，參見例如：T. L. Gilchrist, *Comprehensive Organic Synthesis*, 第 7 卷, 第 748-750 頁, S. V. Ley (編輯), Pergamon Press; M. Tisler 和 B. Stanovnik,

Comprehensive Heterocyclic Chemistry, 第 3 卷, 第 18-20 頁, A. J. Boulton 和 A. McKillop(編輯), Pergamon Press; M. R. Grimmett 和 B. R. T. Keene, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, 第 43 卷, 第 149-161 頁, A. R. Katritzky (編輯), Academic Press; M. Tisler 和 B. Stanovnik, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, 第 9 卷, 第 285-291 頁, A. R. Katritzky 和 A. J. Boulton (編輯), Academic Press; 以及 G. W. H. Cheeseman 和 E. S. g. Werstiuk, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, 第 22 卷, 第 390-392 頁, A. R. Katritzky 和 A. J. Boulton (編輯), Academic Press。

本領域技術人員會認識到, 因為在環境中和生理條件下, 化合物的鹽可與它們相應的非鹽形式存在平衡, 所以鹽與非鹽形式同具有生物學效用。當形成本發明混合物和組合物的化合物含有酸性部分或鹼性部分時, 可形成各種鹽, 並且這些鹽可用於本發明混合物和組合物中以控制由真菌植物病原體引起的植物疾病(即是在農業上合適的)。當化合物含有諸如胺官能之類的鹼性部分時, 鹽包括與無機酸或有機酸例如氫溴酸、鹽酸、硝酸、磷酸、硫酸、乙酸、丁酸、富馬酸、乳酸、馬來酸、丙二酸、草酸、丙酸、水楊酸、酒石酸、4-甲苯磺酸或戊酸的酸加成鹽。當化合物含有諸如羧酸或酚之類的酸性部分時, 鹽包括與有機鹼或無機鹼(例如吡啶、三乙胺或氫、醯胺或鈉、鉀、鋰、鈣、鎂或鋇的氫化物或氫氧化物或碳酸鹽)形成的那些。

選自式 1 的化合物、其立體異構體、互變異構體、*N*-氧化物及鹽，通常以不止一種形式存在，式 1 因而包括式 1 表示的化合物的所有晶體形式和非晶體形式。非晶體形式包括為諸如蠟和膠之類的固體的實施例以及為諸如溶液和熔體之類的液體的實施例。晶體形式包括基本代表單種晶體類型的實施例和代表多晶型物混合物（即不同的晶體類型）的實施例。術語「多晶型物」指可結晶成不同晶體形式的化合物的特定晶體形式，這些形式的晶格內的分子具有不同的排列和/或構象。儘管多晶型物可具有相同的化學組成，但它們也可因為存在或不存在共結晶水或其他分子（其可以弱作用力或強作用力結合在晶格中）而在組成上不同。多晶型物可在諸如晶體形狀、密度、硬度、顏色、化學穩定性、熔點、吸濕性、可懸浮性、溶解速率和生物利用度之類的化學、物理和生物學性質方面不同。本領域技術人員將會知道，式 1 表示的化合物的多晶型物相對於式 1 表示的相同化合物的其他多晶型物或多晶型物混合物，可顯示具有有益效果（如，製備有用製劑的適應性、改善的生物學性能）。式 1 表示的化合物的特定多晶型物的製備和分離可通過本領域技術人員已知的方法（包括例如使用選擇的溶劑和溫度進行結晶）來實現。

「發明內容」中所描述的本發明實施例包括下面描述的那些。在下面的實施例中，式 1 包括它們的幾何異構體和立體異構體、互變異構體、*N*-氧化物及其鹽，並且提及「式 1 化合物」包括「發明內容」中所說明的取代基的定義，除非在實施例中進行了另外定義。

實施例 1. 其中 A 為 -O-、-S-、-N(R⁷)-或 -OC(R⁸)₂- 的式 1 化合物。

實施例 1a. 其中每個 R⁸ 為 H 的式 1 或實施例 1 化合物。

5 實施例 1b. 其中 A 為 -O-、-S-或 -N(R⁷)- 的實施例 1 化合物。

實施例 2. 其中 A 為 -O-或 -N(R⁷)- 的實施例 1b 的化合物。

實施例 3. 其中 A 為 -N(R⁷)- 的實施例 2 的化合物。

10 實施例 3a. 其中 A 為 -O- 的實施例 2 的化合物。

實施例 4. 式 1 或實施例 1 至 3 中任一者的化合物，其中 R⁷ 在單獨出現時（即沒有與 R² 一起）為 H、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基、CH₃C(=O)、CF₃C(=O) 或 CH₃OC(=O)。

15 實施例 5. 實施例 4 的化合物，其中 R⁷ 在單獨出現時為 H 或 C₁-C₂ 烷基。

實施例 5a. 實施例 5 的化合物，其中 R⁷ 在單獨出現時為 H 或甲基。

20 實施例 5b. 式 1 或實施例 1 至 5a 中任一者的化合物，其中 R⁷ 單獨出現。

實施例 6. 式 1 或實施例 1 至 5b 中任一者的化合物，其中 W 為 O。

25 實施例 7. 式 1 或實施例 1 至 6 中任一者的化合物，其中 X 為 X¹、X²、X³、X⁴、X⁵、X⁶、X⁷ 或 X⁸。

實施例 8. 實施例 7 的化合物，其中 X 為 X^1 、 X^2 或 X^3 。

實施例 9. 實施例 8 的化合物，其中 X 為 X^1 或 X^2 。

實施例 10. 實施例 9 的化合物，其中 X 為 X^1 。

5 實施例 11. 式 1 或實施例 1 至 10 中任一者的化合物，其中具有 X 的環是不飽和的。

實施例 12. 式 1 或實施例 1 至 11 中任一者的化合物，其中 Z 為直接鍵、 $CH(R^{12})$ 或 $N(R^{13})$ 。

實施例 13. 實施例 12 的化合物，其中 Z 為直接鍵。

10 實施例 14. 式 1 或實施例 1 至 12 中任一者的化合物，其中每個 R^{13} 獨立為 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烷基羰基或 C_2 - C_3 烷氧基羰基。

實施例 15. 式 1 或實施例 1 至 14 中任一者的化合物，其中

15 每個 R^5 獨立地為鹵素、氰基、羥基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基或 C_1 - C_2 烷氧基；或者

兩個 R^5 基團合在一起為 C_1 - C_3 伸烷基或 C_2 - C_3 伸烯基，以形成橋聯雙環系統；或者

與由雙鍵接合的相鄰環碳原子結合的兩個 R^5 基團合在一起為 $-CH=CH-CH=CH-$ ，該 $-CH=CH-CH=CH-$ 任選經最多 2 個獨立選自鹵素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基和 C_1 - C_4 烷氧基的取代基取代。

20 實施例 16. 實施例 15 的化合物，其中每個 R^5 獨立地為鹵素、氰基、羥基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基或 C_1 - C_2 烷氧基。

25

實施例 17. 實施例 16 的化合物，其中每個 R^5 獨立地為鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基或 C_1 - C_2 烷氧基。

5 實施例 18. 實施例 17 的化合物，其中每個 R^5 獨立地為氰基、甲基或甲氧基。

實施例 19. 實施例 18 的化合物，其中每個 R^5 為甲基。

實施例 20. 式 1 或實施例 1 至 19 中任一者的化合物，其中 n 為 0 或 1。

10 實施例 21. 實施例 20 的化合物，其中 n 為 0。

實施例 22. 式 1 或實施例 1 至 21 中任一者的化合物，其中 R^1 在單獨出現時（即沒有與 R^2 一起時）為 H、氰基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 鹵烯基、 C_2 - C_4 鹵炔基、 C_2 - C_4 烷氧基烷基、 C_2 - C_4 烷硫基烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_4 烯氧基、 C_2 - C_4 鹵烯氧基、 C_2 - C_4 炔氧基、 C_3 - C_4 鹵炔氧基、 C_2 - C_4 烷氧基烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 烷基胺基、 C_2 - C_4 二烷基胺基、 C_1 - C_4 鹵烷基胺基或 C_2 - C_4 鹵二烷基胺基。

25 實施例 23. 實施例 22 的化合物，其中 R^1 在單獨出現時為 H、氰基、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烯基、 C_2 - C_3 炔基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_2 - C_3 鹵烯基、 C_2 - C_3 鹵炔基、 C_1 - C_3 烷氧基或 C_1 - C_3 鹵烷氧基。

實施例 24. 實施例 23 的化合物，其中 R^1 在單獨出現時為 H、 C_1-C_3 烷基或 C_1-C_3 鹵烷基。

實施例 25. 實施例 24 的化合物，其中 R^1 在單獨出現時為 H、 C_1-C_3 烷基或 C_1-C_3 氟烷基。

5 實施例 26. 實施例 25 的化合物，其中 R^1 在單獨出現時為 H、甲基、三氟甲基或 CF_3CH_2 。

實施例 26a. 實施例 26 的化合物，其中 R^1 在單獨出現時為甲基、三氟甲基或 CF_3CH_2 。

10 實施例 26a. 式 1 或實施例 1 至 26 中任一者的化合物，其中 R^1 單獨出現。

實施例 27. 式 1 或實施例 1 至 26a 中任一者的化合物，其中 R^2 在單獨出現時（即沒有與 R^1 或 R^7 一起）為 H、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 烷氧基或 C_1-C_3 鹵烷基。

15 實施例 28. 實施例 27 的化合物，其中 R^2 在單獨出現時為 H、 C_1-C_3 烷基或 C_1-C_3 鹵烷基。

20 實施例 29. 實施例 28 的化合物，其中 R^2 在單獨出現時為 H、 C_1-C_2 烷基或 C_1-C_3 氟烷基。

實施例 29a. 實施例 29 的化合物，其中 R^2 在單獨出現時為 H、甲基或三氟甲基。

實施例 29b. 式 1 或實施例 1 至 29a 中任一者的化合物，其中 R^2 單獨出現。

25 實施例 30. 式 1 或實施例 1 至 29b 中任一者的化合物，其中當 R^1 和 R^2 與它們連接的碳原子一起形成環時，該環具有選自碳原子和最多 2 個雜原子的 3-至 6-員，所述雜原子獨立選自最多 2

個 O、最多 2 個 S 和最多 2 個 N，其中最多 1 個碳原子環員為 C(=O)或 C(=S)並且該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₁-C₂ 烷氧基和 C₁-C₂ 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 烷氧基的取代基取代。

實施例 30a. 實施例 30 的化合物，其中 R¹ 和 R² 與它們連接的碳原子一起形成實施例 30 中所定義的環。

實施例 31. 式 1 或實施例 1 至 30a 中任一者的化合物，其中當 R² 和 R⁷ 與它們連接的相連原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環時，除了相連原子外所述環還含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，該環任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₁-C₂ 烷氧基和 C₁-C₂ 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 烷氧基的取代基取代。

實施例 31a. 實施例 31 的化合物，其中 R² 和 R⁷ 與它們連接的相連原子一起形成實施例 31 中所定義的環。

實施例 32. 實施例 31 的化合物，其中當 R² 和 R⁷ 與它們連接的相連原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環時，除了相連原子外所述環還含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述雜原

子獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，並且該環的碳環原子上任選經最多 2 個獨立選自鹵素和 C₁-C₂ 烷基的取代基取代。

5 實施例 32a. 實施例 32 的化合物，其中 R² 和 R⁷ 與它們連接的相連原子一起形成實施例 32 中所定義的環。

實施例 32b. 實施例 32 的化合物，其中 R² 和 R⁷ 與它們連接的相連原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環時，除了相連原子外所述環還含有選自碳原子的環員，該環係任選經最多 2 個獨立選自 C₁-C₂ 烷基的取代基取代。

實施例 32c. 實施例 32b 的化合物，其中 R² 和 R⁷ 與它們連接的相連原子一起形成實施例 32b 中所定義的環。

15 實施例 33. 式 1 或實施例 1 至 32a 中任一者的化合物，其中 R³ 為經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環；或 H、氰基、羥基、C₁-C₃ 烷基、C₂-C₃ 烯基、C₂-C₃ 炔基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₂-C₃ 鹵烯基、C₂-C₃ 鹵炔基、C₂-C₃ 烷基羰基、C₂-C₃ 鹵烷基羰基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基、C₁-C₃ 烷硫基、C₁-C₃ 鹵烷硫基、C₂-C₃ 烷基羰基氧基或 C₂-C₃ 鹵烷基羰基氧基。

25 實施例 34. 實施例 33 的化合物，其中 R³ 為 H、氰基、羥基、C₁-C₃ 烷基、C₂-C₃ 烯基、C₂-C₃ 炔基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₂-C₃ 鹵烯基、C₂-C₃ 鹵炔

基、C₂-C₃ 烷基羰基、C₂-C₃ 鹵烷基羰基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基、C₁-C₃ 烷硫基、C₁-C₃ 鹵烷硫基、C₂-C₃ 烷基羰基氧基或 C₂-C₃ 鹵烷基羰基氧基。

5 實施例 35. 實施例 34 的化合物，其中 R³ 為 H、氟基、羥基、C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基、C₁-C₃ 烷硫基、C₁-C₃ 鹵烷硫基、C₂-C₃ 烷基羰基氧基或 C₂-C₃ 鹵烷基羰基氧基。

10 實施例 36. 實施例 35 的化合物，其中 R³ 為 H、氟基、甲基、甲氧基或 CH₃C(=O)O-。

實施例 37. 實施例 36 的化合物，其中 R³ 為 H 或甲基。

實施例 37a. 實施例 37 的化合物，其中 R³ 為 H。

15 實施例 38. 式 1 或實施例 1 至 33 中任一者的化合物，其中當 R³ 為經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環時，所述經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環是經最多 3
20 個可選的取代基取代。

實施例 38a. 實施例 38 的化合物，其中當 R³ 為經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環時，所述經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至
25 6-員雜芳環是經最多 2 個可選的取代基取代。

實施例 38b. 式 1 或實施例 1 至 38a 中任一者的化合物，其中當 R^3 為經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環時，則苯基、萘基或 5-至 6-員雜芳環上的可選取代基獨立選自碳原子環員上的 R^{25a} 和氮原子環員上的 R^{25b} ；

每個 R^{25a} 獨立地為鹵素、氰基、羥基、胺基、硝基、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷基、 C_4 - C_{10} 烷基環烷基、 C_5 - C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷基磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷基胺基、 C_2 - C_8 二烷基胺基、 C_3 - C_6 環烷基胺基、 C_2 - C_4 烷氧基烷基、 C_1 - C_4 羥烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_6 烷氧基羰基、 C_2 - C_6 烷基羰基氧基、 C_2 - C_6 烷基羰基硫基、 C_2 - C_6 烷基胺基羰基、 C_3 - C_8 二烷基胺基羰基或 C_3 - C_6 三烷基矽烷基；並且

每個 R^{25b} 獨立地為 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_6 烯基、 C_3 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_3 - C_6 鹵烯基、 C_3 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基或 C_2 - C_4 烷氧基烷基。

實施例 39. 實施例 38b 的化合物，其中每個 R^{25a} 獨立地為鹵素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基或 C_1 - C_2 烷氧基。

實施例 40. 實施例 39 的化合物，其中每個 R^{25a} 獨立地為 Cl、Br、I、 C_1 - C_2 烷基、三氟甲基或甲氧基。

實施例 41. 實施例 40 的化合物，其中每個 R^{25a} 獨立地為 Cl、Br、 C_1 - C_2 烷基或三氟甲基。

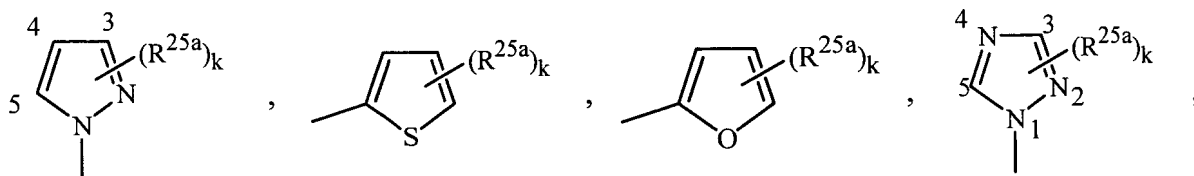
實施例 41a. 實施例 38b 的化合物，其中每個 R^{25b} 獨立地為 C_1 - C_2 烷基、環丙基或 C_2 - C_4 烷氧基烷基。

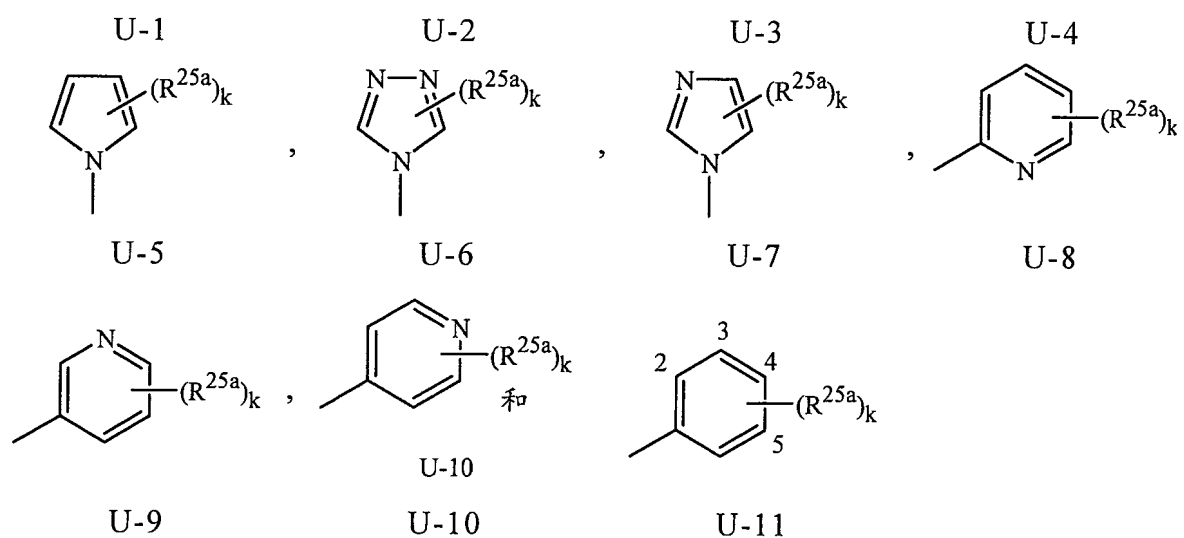
實施例 41b. 實施例 41a 的化合物，其中每個 R^{25b} 為甲基。

實施例 42. 式 1 或實施例 1 至 41 中任一者的化合物，其中當 R^3 是經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或一經任選取代的 5-至 6-員雜芳環時，則 R^3 不是經任選取代的萘基。

實施例 43. 式 1 或實施例 1 至 42 中任一者的化合物，其中當 R^3 為經任選取代的苯基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環時，則 R^3 選自示例 1 中的 U-1 至 U-11。

示例 1





其中向左伸出的鍵連接至式 1；且 k 為 0、1 或 2。

實施例 44. 實施例 43 的化合物，其中 R^3 選自 U-1、U-4 與 U-11。

5 實施例 45. 實施例 44 的化合物，其中 R^3 為 U-1。

實施例 45a. 實施例 33 至 45 任何其中之一的化合物，其中當 R^3 是經任選取代的苯基或一經任選取代的 5-至 6-員雜芳環時，則 R^3 選自 U-1 至 U-11；或者當 R^3 為 H、氰基、羥基、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烯基、 C_2 - C_3 炔基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_2 - C_3 鹵烯基、 C_2 - C_3 鹵炔基、 C_2 - C_3 烷基羰基、 C_2 - C_3 鹵烷基羰基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 鹵烷氧基、 C_1 - C_3 烷硫基、 C_1 - C_3 鹵烷硫基、 C_2 - C_3 烷基羰基氧基或 C_2 - C_3 鹵烷基羰基氧基，則 R^3 選自 H、氰基、羥基、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 鹵烷氧基、 C_1 - C_3 烷硫基、 C_1 - C_3 鹵烷硫基、 C_2 - C_3 烷基羰基氧基或 C_2 - C_3 鹵烷基羰基氧基。

15

實施例 46. 式 1 或實施例 1 至 45a 中任一者的化合物，其中 R^4 為 H 或 C_1-C_2 烷基。

實施例 47. 實施例 46 的化合物，其中 R^4 為 H。

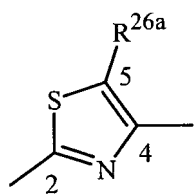
實施例 48. 式 1 或實施例 1 至 47 中任一者的化合物，其中 G 為 5 員雜環，任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的 R^{26} 和氮原子環員上的 R^{27} 的取代基取代；

每個 R^{26} 獨立地為鹵素、 C_1-C_3 烷基或 C_1-C_3 鹵烷基；並且

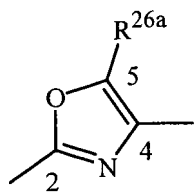
每個 R^{27} 獨立地為 C_1-C_3 烷基。

實施例 49. 實施例 48 的化合物，其中 G 為選自示例 2 中 G-1 至 G-59 的 5 員雜環。

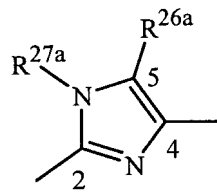
示例 2



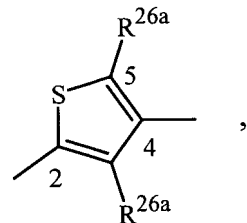
G-1



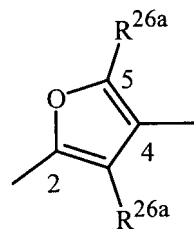
G-2



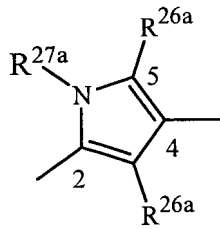
G-3



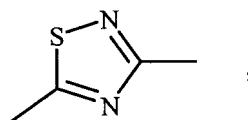
G-4



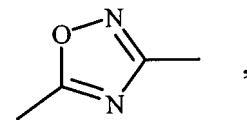
G-5



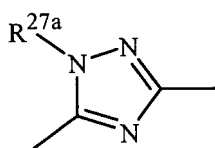
G-6



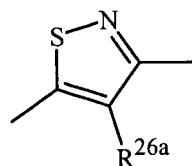
G-7



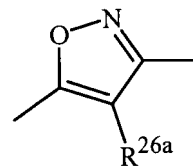
G-8



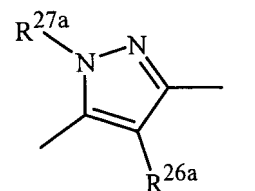
G-9



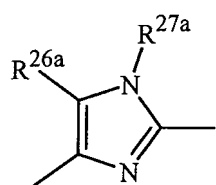
G-10



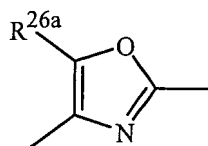
G-11



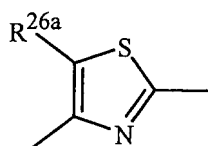
G-12



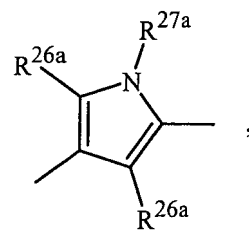
G-13



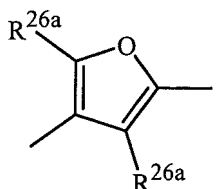
G-14



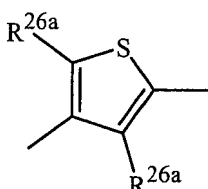
G-15



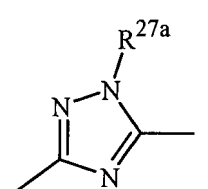
G-16



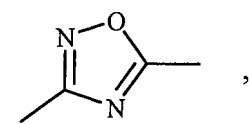
G-17



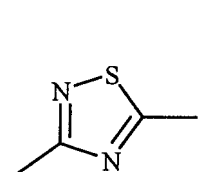
G-18



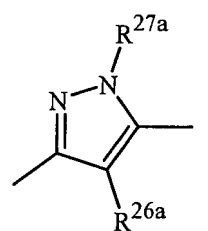
G-19



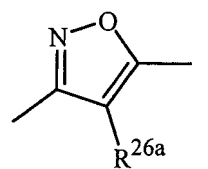
G-20



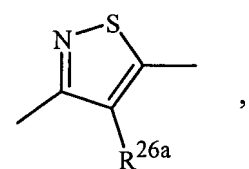
G-21



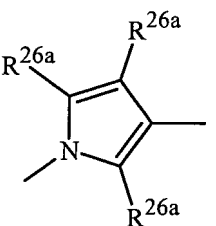
G-22



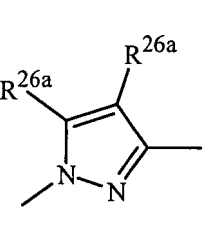
G-23



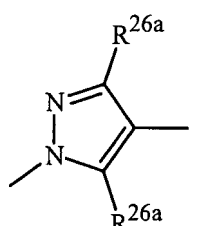
G-24



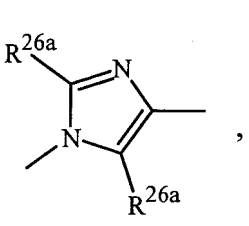
G-25



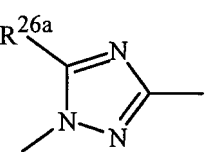
G-26



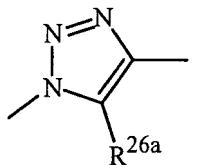
G-27



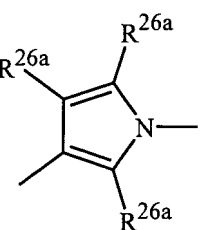
G-28



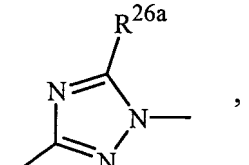
G-29



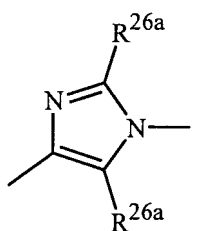
G-30



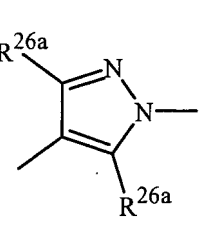
G-31



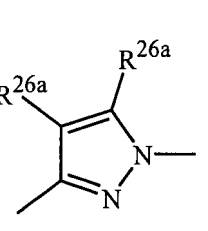
G-32



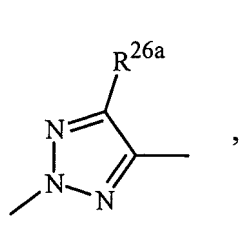
G-33



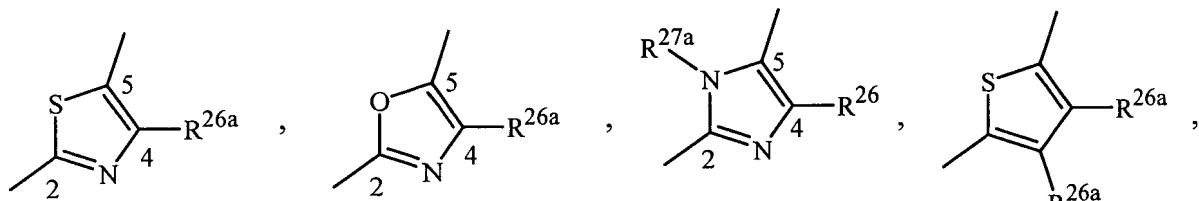
G-34



G-35



G-36

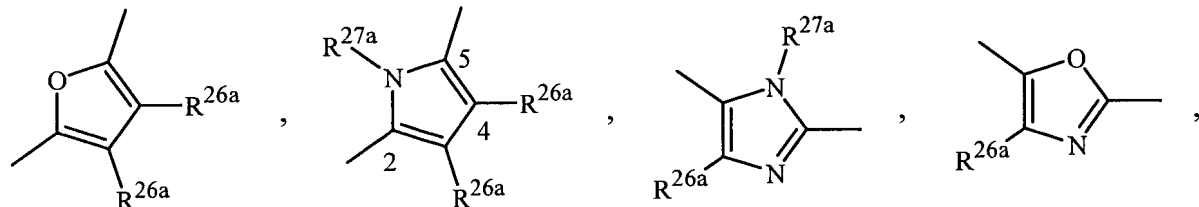


G-37

G-38

G-39

G-40

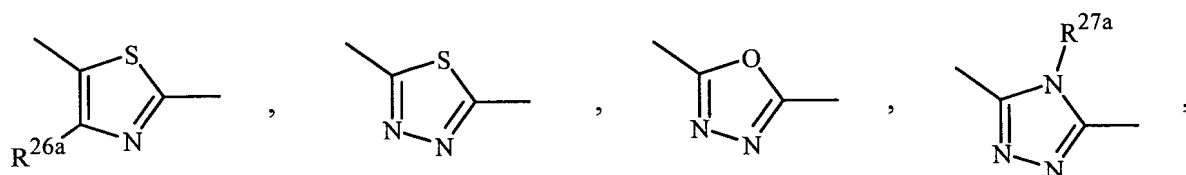


G-41

G-42

G-43

G-44

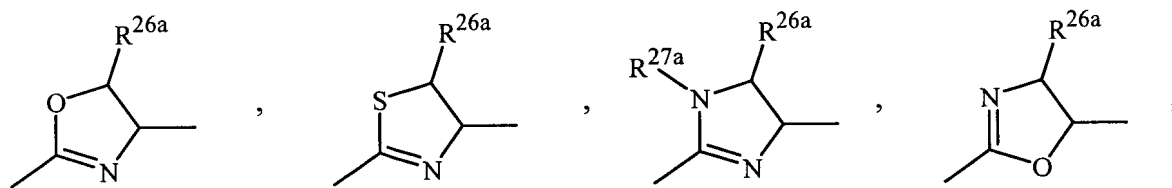


G-45

G-46

G-47

G-48

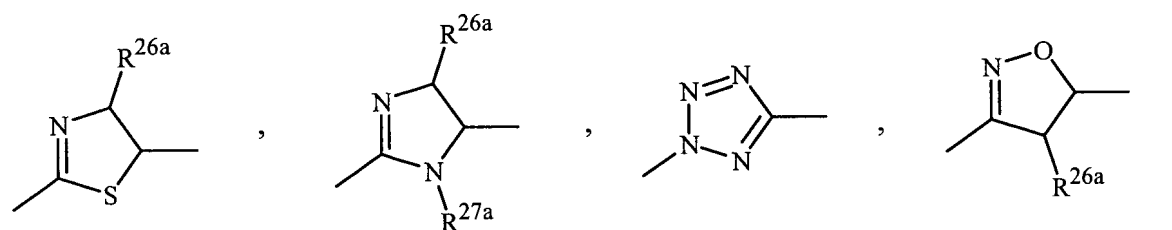


G-49

G-50

G-51

G-52

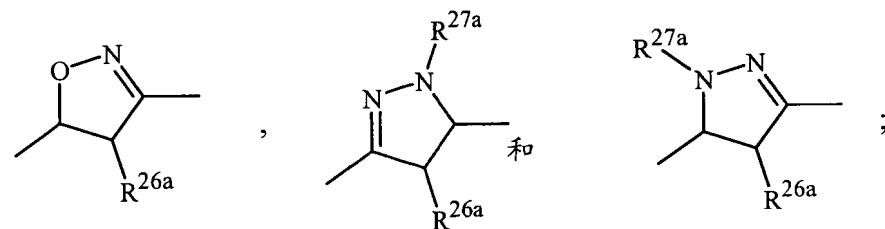


G-53

G-54

G-55

G-56



G-57

G-58

G-59

其中向左伸出的鍵連接至 X，而向右伸出的鍵連接至式 1 中的 Z；每個 R^{26a} 獨立選自 H 和 R^{26} ；而 R^{27a} 選自 H 和 R^{27} 。

5 實施例 50. 實施例 49 的化合物，其中 G 選自 G-1 至 G-3、G-7、G-8、G-10、G-11、G-14、G-15、G-23、G-24、G-26 至 G-28、G-30、G-36 至 G-38 和 G-49 至 G-55。

10 實施例 51. 實施例 50 的化合物，其中 G 選自 G-1、G-2、G-7、G-8、G-14、G-15、G-23、G-24、G-26、G-27、G-36、G-37、G-38、G-49、G-50 和 G-55。

實施例 52. 實施例 51 的化合物，其中 G 選自 G-1、G-2、G-15、G-26、G-27、G-36、G-37 和 G-38。

15 實施例 53. 實施例 52 的化合物，其中 G 選自 G-1、G-2、G-15、G-26 和 G-36。

實施例 54. 實施例 53 的化合物，其中 G 為 G-1。

實施例 55. 實施例 53 的化合物，其中 G 為 G-2。

實施例 56. 實施例 53 的化合物，其中 G 為 G-15。

實施例 57. 實施例 53 的化合物，其中 G 為 G-26。

20 實施例 58. 實施例 53 的化合物，其中 G 為 G-36。

實施例 59. 實施例 49 至 58 中任一者的化合物，其中每個 R^{26a} 獨立地為 H、鹵素或 C_1 - C_3 烷基。

實施例 60. 實施例 59 的化合物，其中每個 R^{26a} 獨立為 H 或甲基。

25 實施例 61. 實施例 60 的化合物，其中 R^{26a} 為 H。

實施例 62. 實施例 49 至 61 任一者中的化合物，其中每個 R^{27} 獨立為 H 或甲基。

實施例 62a. 實施例 62 的化合物，其中每個 R^{27a} 為 H。

5 實施例 62b. 式 1 或實施例 48 至 62a 中任一者的化合物，其中 G 為未被取代的雜環，它與 X 和 Z 的連接基除外。

10 實施例 63. 式 1 或實施例 1 至 62b 中任一者的化合物，其中 J 為 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 4 個 N，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 C(=O) 和 C(=S)，而硫原子環員獨立選自 S(=O)_s(=NR¹¹)_f，每個環或環系統任選經最多 5
15 個獨立選自 R⁶ 的取代基取代；或者當 Z 為直接鍵時，J 也為 C(=W²) NT^AT^B。

20 實施例 63a. 實施例 63 的化合物，其中 J 為 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 4 個 N，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 C(=O) 和 C(=S)，而硫
25 原子環員獨立選自 S(=O)_s(=NR¹¹)_f，每個環或環系統經一-Z²Q 取代基取代並且任選經最多 3

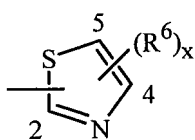
個獨立選自非-Z²Q 的 R⁶ 取代基取代或者當 Z 為直接鍵時，J 也為 C(=W²) NT^AT^B。

5 實施例 63b. 實施例 63a 的化合物，其中 J 為 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 4 個 N，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 C(=O)和 C(=S)，而 10 硫原子環員獨立選自 S(=O)_s(=NR¹¹)_f，每個環或環系統經一-Z²Q 取代基取代並且任選經 1 個獨立選自非-Z²Q 的 R⁶ 取代基取代或者當 Z 為直接鍵時，J 也為 C(=W²) NT^AT^B。

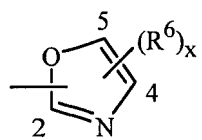
15 實施例 63c. 實施例 63 的化合物，其中 J 為 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 4 個 N，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 C(=O)和 C(=S)，而硫 20 原子環員獨立選自 S(=O)_s(=NR¹¹)_f，每個環或環系統經一-Z²Q 取代基取代並且任選經 1 或 2 個獨立選自非-Z²Q 的 R⁶ 取代基取代或者當 Z 為直接鍵時，J 也為 C(=W²) NT^AT^B。

25 實施例 64. 實施例 63 的化合物，其中當 J 不是 C(=W²) NT^AT^B 時，J 為選自由示例 3 中 J-1 至 J-82 的環。

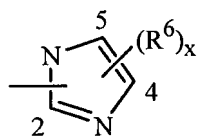
示例 3



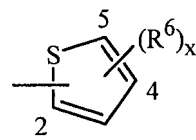
J-1



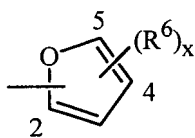
J-2



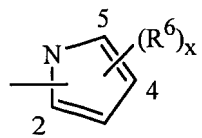
J-3



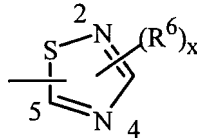
J-4



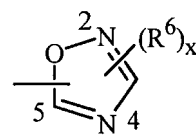
J-5



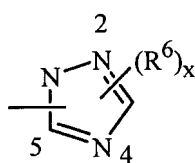
J-6



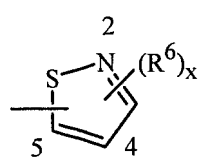
J-7



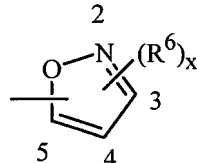
J-8



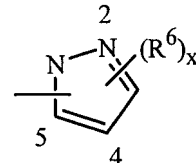
J-9



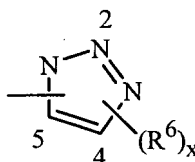
J-10



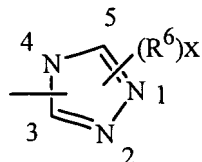
J-11



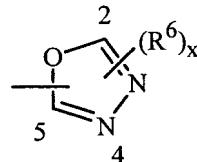
J-12



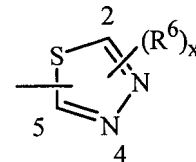
J-13



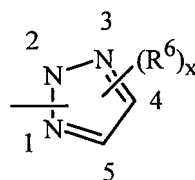
J-14



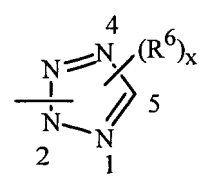
J-15



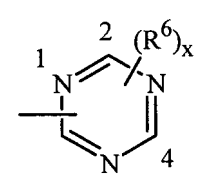
J-16



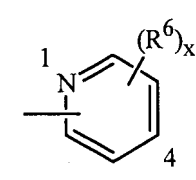
J-17



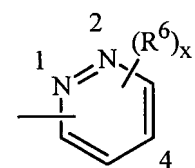
J-18



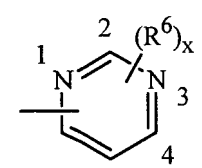
J-19



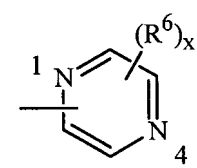
J-20



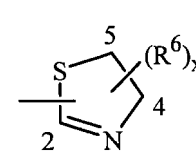
J-21



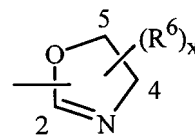
J-22



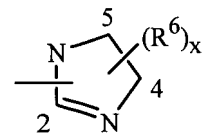
J-23



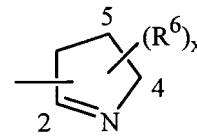
J-24



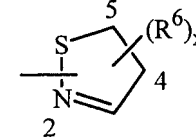
J-25



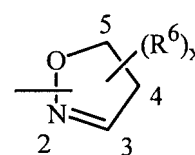
J-26



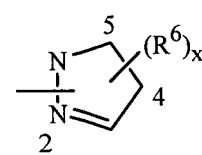
J-27



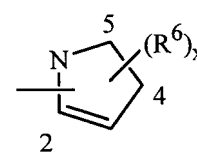
J-28



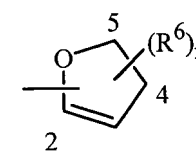
J-29



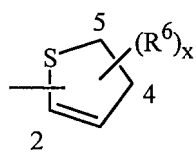
J-30



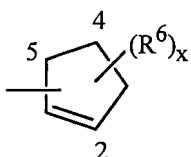
J-31



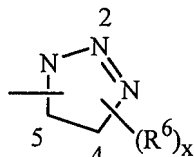
J-32



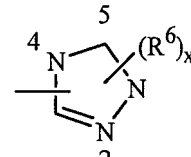
J-33



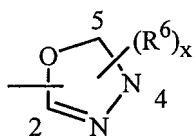
J-34



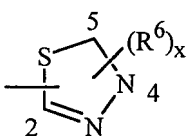
J-35



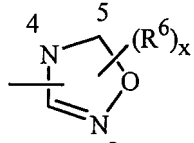
J-36



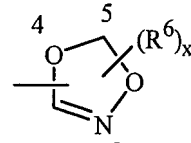
J-37



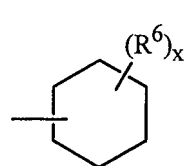
J-38



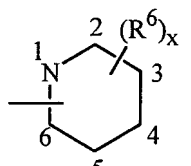
J-39



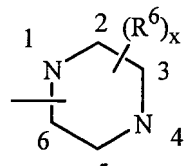
J-40



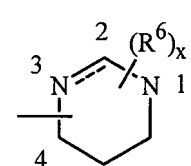
J-41



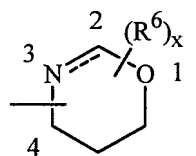
J-42



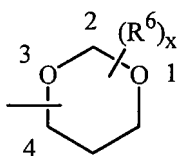
J-43



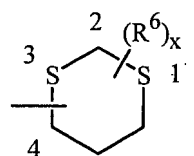
J-44



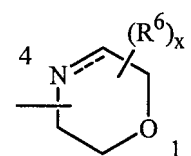
J-45



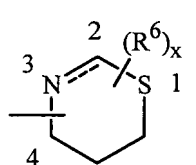
J-46



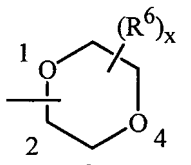
J-47



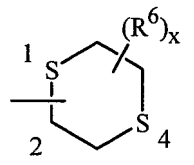
J-48



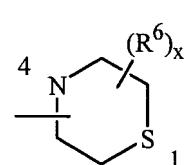
J-49



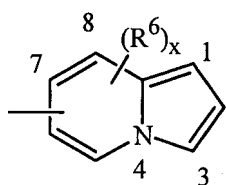
J-50



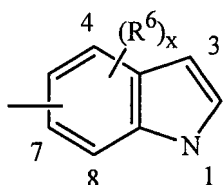
J-51



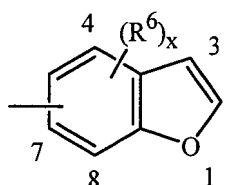
J-52



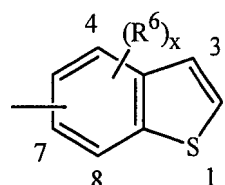
J-53



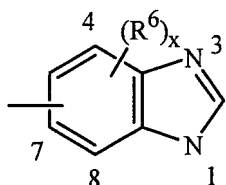
J-54



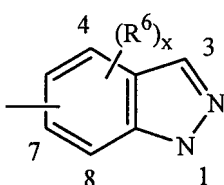
J-55



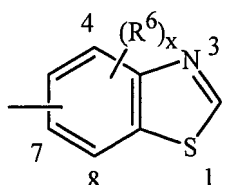
J-56



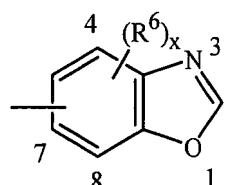
J-57



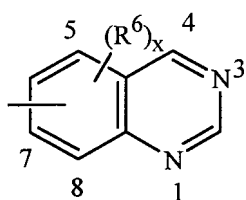
J-58



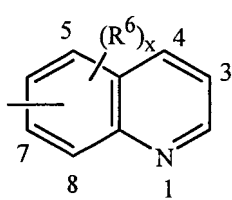
J-59



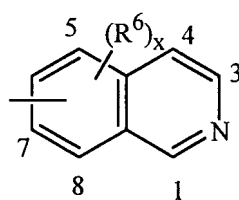
J-60



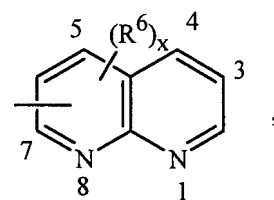
J-61



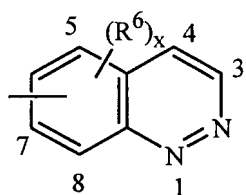
J-62



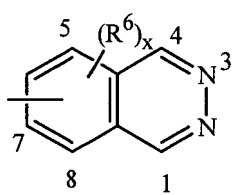
J-63



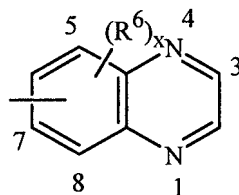
J-64



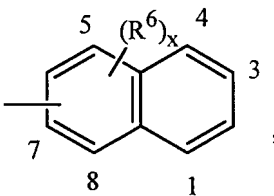
J-65



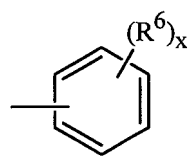
J-66



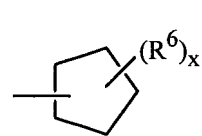
J-67



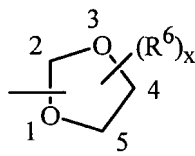
J-68



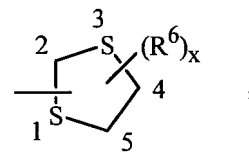
J-69



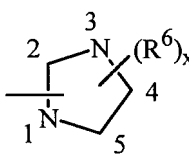
J-70



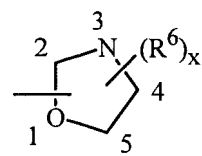
J-71



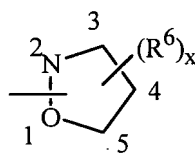
J-72



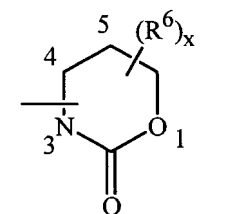
J-73



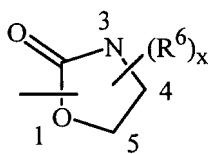
J-74



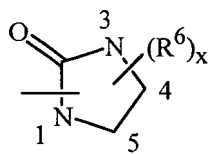
J-75



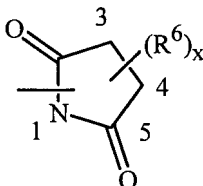
J-76



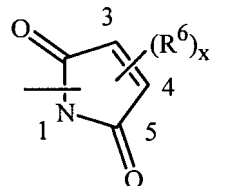
J-77



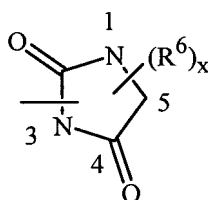
J-78



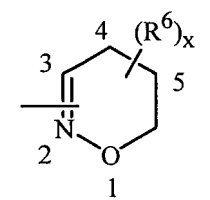
J-79



J-80



J-81



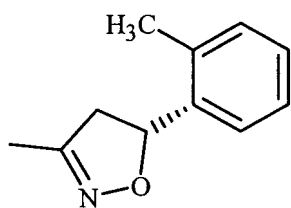
J-82

其中該浮動鍵透過所述環或環系統中的可用碳或氮原子環員連接至式 1 中的 Z；並且 X 為 0 至 5 的整數。

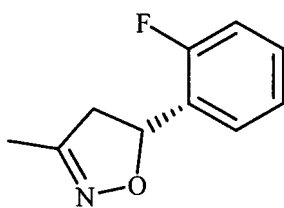
實施例 64a. 實施例 64 的化合物，其中 J 為選自 J-1 至 J-82 的環所組成的群組，X 為 1 至 5 的整數，而當 X 為 2、3、4 或 5 的整數時，則最多一 R⁶ 的例子為 -Z²Q。

5 實施例 65. 實施例 64 或 64a 的化合物，其中 J 為選自示例 A 中 J-29-1 至 J-29-60 的環。

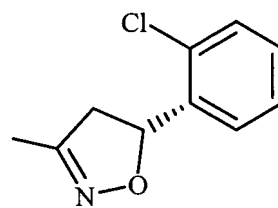
示例 A



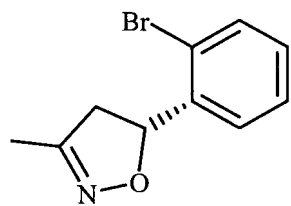
J-29-1



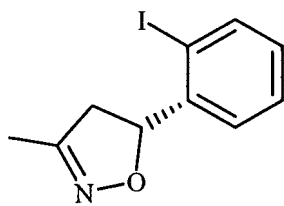
J-29-2



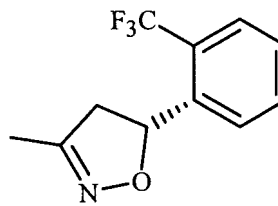
J-29-3



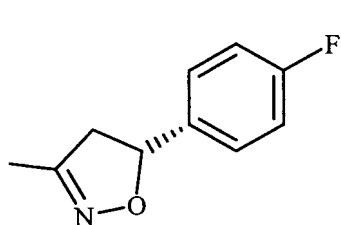
J-29-4



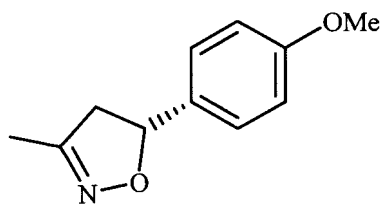
J-29-5



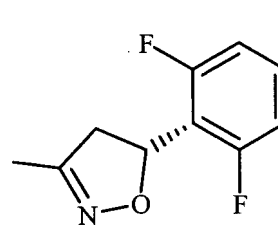
J-29-6



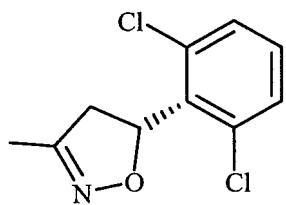
J-29-7



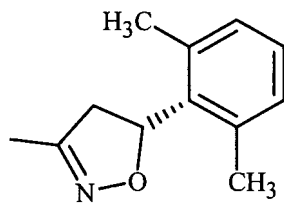
J-29-8



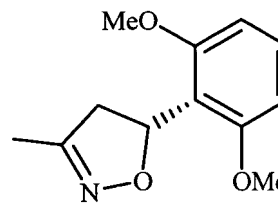
J-29-9



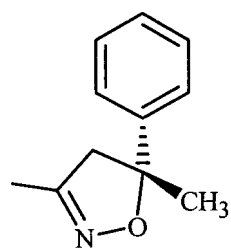
J-29-10



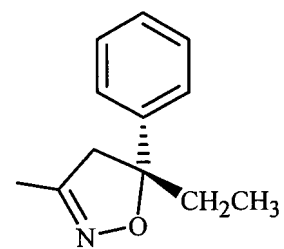
J-29-11



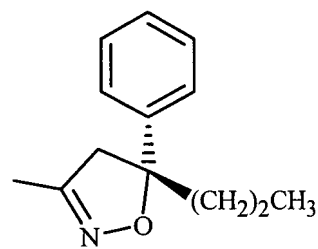
J-29-12



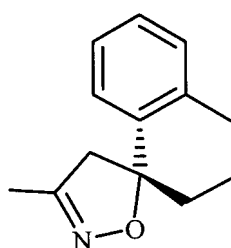
J-29-13



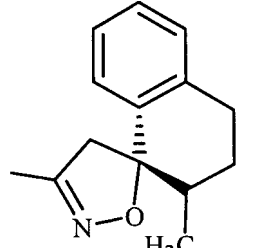
J-29-14



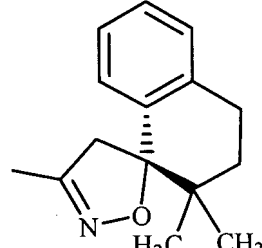
J-29-15



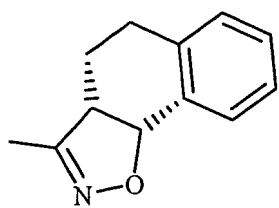
J-29-16



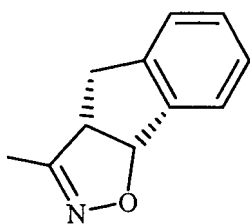
J-29-17



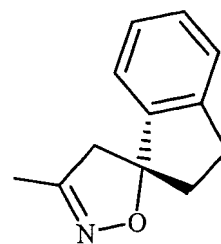
J-29-18



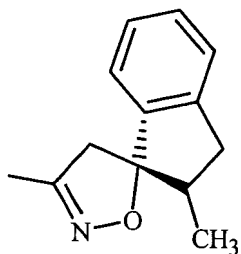
J-29-19



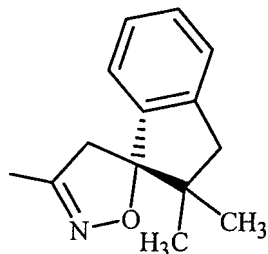
J-29-20



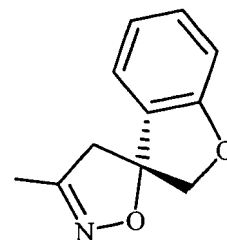
J-29-21



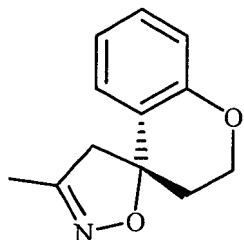
J-29-22



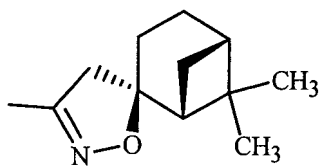
J-29-23



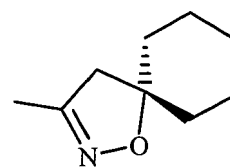
J-29-24



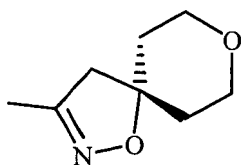
J-29-25



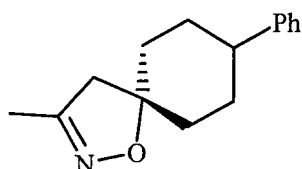
J-29-26



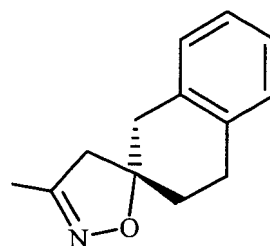
J-29-27



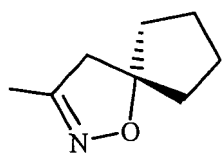
J-29-28



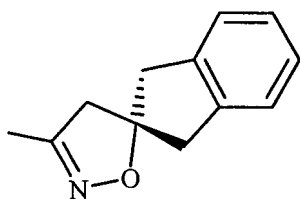
J-29-29



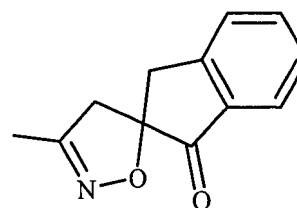
J-29-30



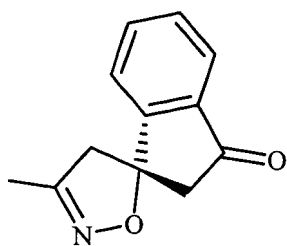
J-29-31



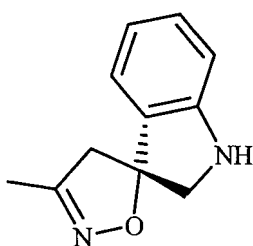
J-29-32



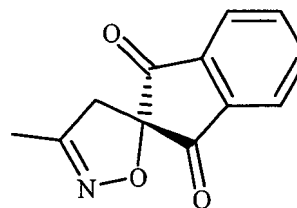
J-29-33



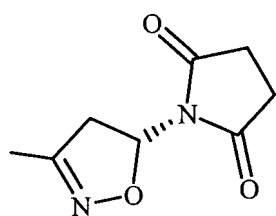
J-29-34



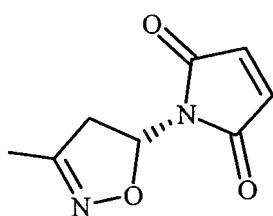
J-29-35



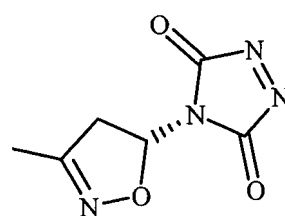
J-29-36



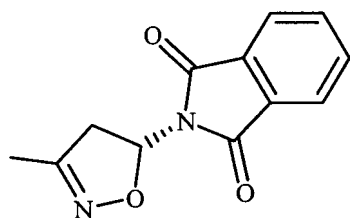
J-29-37



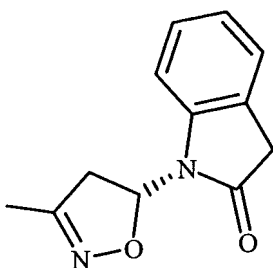
J-29-38



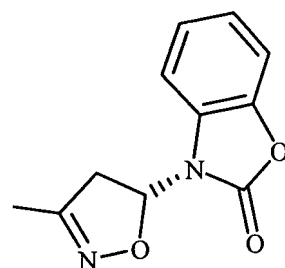
J-29-39



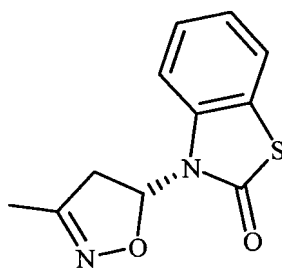
J-29-40



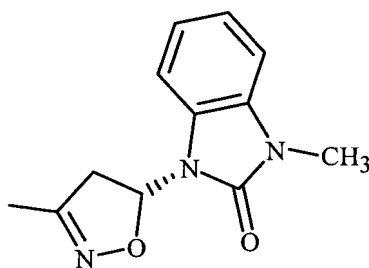
J-29-41



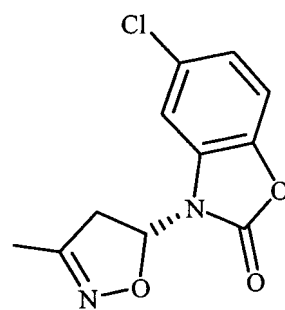
J-29-42



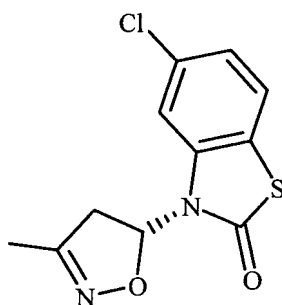
J-29-43



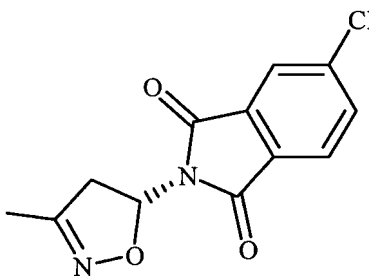
J-29-44



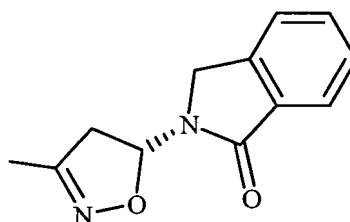
J-29-45



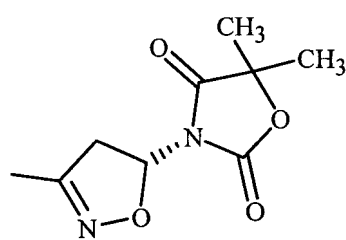
J-29-46



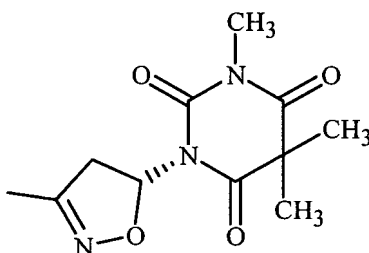
J-29-47



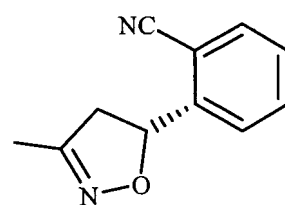
J-29-48



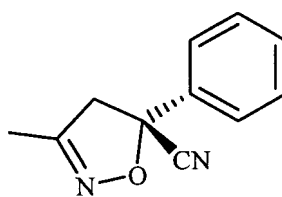
J-29-49



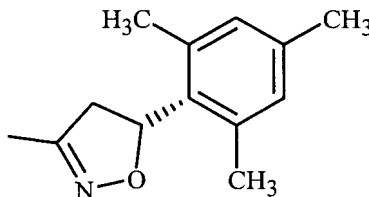
J-29-50



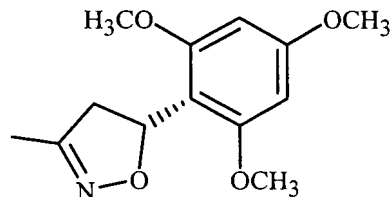
J-29-51



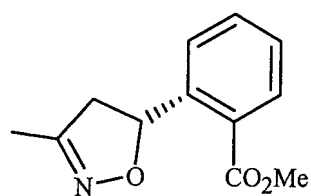
J-29-52



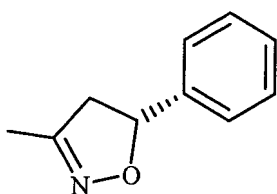
J-29-53



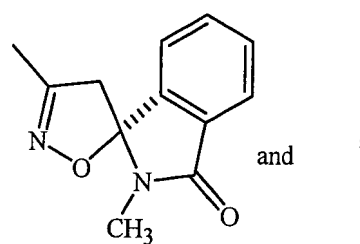
J-29-54



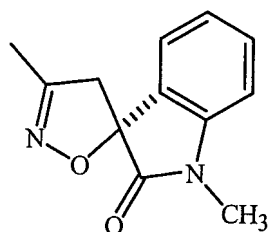
J-29-55



J-29-58



J-29-59



J-29-60

其中向左伸出的鍵連接至式 1 中的 Z。

實施例 66. 實施例 64 或 64a 的化合物，其中 J 選自 J-1、J-2、J-3、J-4、J-5、J-7、J-8、J-9、J-10、J-11、J-12、J-14、J-15、J-16、J-20、J-24、J-25、J-26、J-29、J-30、J-37、J-38、J-45 和 J-69。

實施例 67. 實施例 66 的化合物，其中 J 選自 J-4、J-5、J-8、J-11、J-15、J-16、J-20、J-29、J-30、J-37、J-38 和 J-69。

實施例 68. 實施例 67 的化合物，其中 J 選自 J-4、J-5、J-11、J-20、J-29、J-37、J-38 和 J-69。

實施例 69. 實施例 68 的化合物，其中 J 為 J-11。

實施例 70. 實施例 68 的化合物，其中 J 為 J-29。

實施例 71. 實施例 68 的化合物，其中 J 為 J-69。

實施例 72. 實施例 64 至 71 中任一者的化合物，其中 X 為 1、2 或 3。

實施例 72a. 實施例 64 至 71 中任一者的化合物，其中 X 為 1 或 2。

實施例 73. 實施例 72a 的化合物，其中 X 為 1。

實施例 74. 實施例 69 的化合物，其中 J-11 的 3-位置連接至式 1 的 Z，並且 J-11 在 5-位置被選自 R^6 而不是 H 的基團取代。

5 實施例 75. 實施例 74 的化合物，其中 J-11 的 3-位置連接至式 1 的 Z，並且 J-11 在 5-位置被 $-Z^2Q$ 取代。

實施例 76. 實施例 70 的化合物，其中 J-29 的 3-位置連接至式 1 的 Z，並且 J-29 在 5-位置被選自 R^6 而不是 H 的取代基取代。

10

實施例 77. 實施例 76 的化合物，其中 J-29 的 3-位置連接至式 1 的 Z，並且 J-29 在 5-位置被 $-Z^2Q$ 取代。

實施例 78. 式 1 或實施例 1 至 77 中任一者的化合物，其中每個 R^6 在單獨出現時（即沒有與 R^{6a} 一起使用時）獨立地為 H、鹵素、氰基、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵炔基、 C_3-C_8 環烷基、 C_3-C_8 鹵環烷基、 C_4-C_{10} 烷基環烷基、 C_4-C_{10} 環烷基烷基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 C_4-C_{10} 環烷氧基烷基、 C_3-C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2-C_6 烷硫基烷基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_3-C_8 環烷氧基、 C_3-C_8 鹵環烷氧基、 C_4-C_{10} 環烷基烷氧基、 C_2-C_6 烯氧基、 C_2-C_6 鹵烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_2-C_6 鹵炔氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷氧基、 C_2-C_6 烷基羰基氧

20

25

基、C₂-C₆ 鹵烷基羰基氧基、C₄-C₈ 環烷基羰基氧基、C₃-C₆ 烷基羰基烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 鹵烷硫基、C₃-C₈ 環烷硫基、C₃-C₁₀ 三烷基矽烷基、-NR¹⁷R¹⁸ 或-Z²Q。

5 實施例 79. 實施例 78 的化合物，其中每個 R⁶ 在單獨出現時獨立地為 H、氰基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₃-C₈ 環烷基、C₃-C₈ 鹵環烷基、C₂-C₆ 烷氧基烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、C₃-C₈ 環烷氧基、C₂-C₆ 烯氧基、C₂-C₆ 鹵烯氧基、C₂-C₆ 炔氧基、C₂-C₆ 烷氧基烷氧基、C₂-C₆ 烷基羰基氧基、C₂-C₆ 鹵烷基羰基氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 鹵烷硫基、C₃-C₁₀ 三烷基矽烷基、-NR¹⁷R¹⁸ 或-Z²Q。

10 實施例 80. 實施例 78 的化合物，其中每個 R⁶ 在單獨出現時獨立地為 H、鹵素、氰基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、-NR¹⁷R¹⁸ 或-Z²Q。

15 實施例 80a. 實施例 80 的化合物，其中每個 R⁶ 在單獨出現時獨立地為 H、氰基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、-NR¹⁷R¹⁸ 或-Z²Q。

20 實施例 80b. 實施例 80a 的化合物，其中每個 R⁶ 在單獨出現時獨立地為 H、氰基、C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基、-NR¹⁷R¹⁸ 或-Z²Q。

25

實施例 81. 實施例 78 的化合物，其中每個 R^6 在單獨出現時獨立地為 H、鹵素、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基或 $-Z^2Q$ 。

5 實施例 81a. 實施例 81 的化合物，其中每個 R^6 在單獨出現時獨立地為 H、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基或 $-Z^2Q$ 。

實施例 82. 實施例 81 的化合物，其中每個 R^6 在單獨出現時為 $-Z^2Q$ 。

10 實施例 79a. 式 1 或實施例 1 至 81 中任一者的化合物，其中每個 R^6 為單獨出現。

實施例 83. 式 1 或實施例 1 至 82 中任一者的化合物，其中每個 Z^2 獨立地為直接鍵、O、 $C(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 或 $CH(R^{12})$ 。

15 實施例 84. 實施例 83 的化合物，其中每個 Z^2 為直接鍵。

實施例 85. 式 1 或實施例 1 至 84 中任一者的化合物，其中每個 R^{18} 獨立地為 C_1-C_3 烷基或 $-Z^3Q$ 。

實施例 86. 實施例 85 的化合物，其中每個 R^{18} 獨立地為 C_1-C_3 烷基。

20 實施例 87. 式 1 或實施例 1 至 85 中任一者的化合物，其中每個 Z^3 獨立地為 $C(=O)$ 或 $S(=O)_2$ 。

實施例 88. 實施例 87 的化合物，其中每個 Z^3 為 $C(=O)$ 。

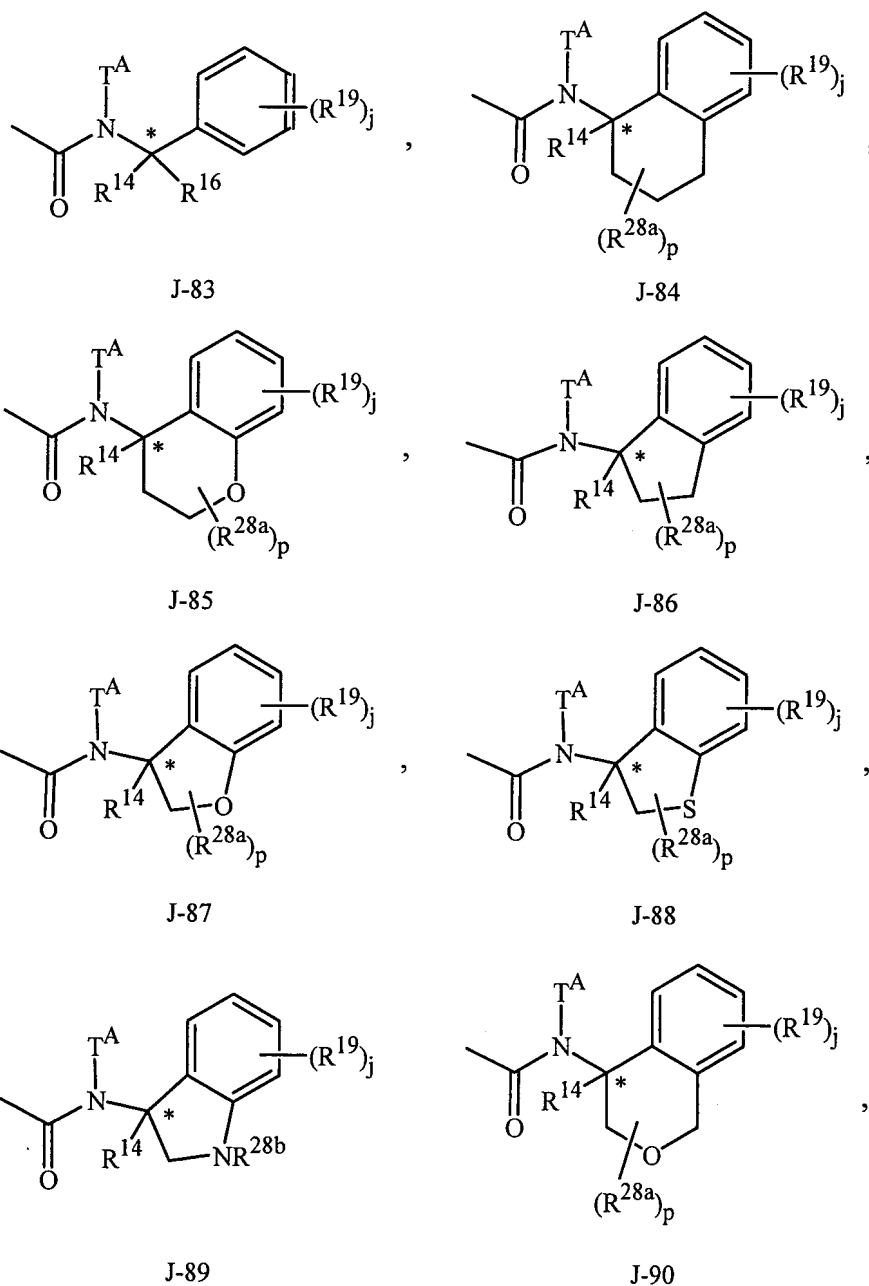
25 實施例 89. 式 1 或實施例 1 至 88 中任一者的化合物，其中僅在一種情況下 R^6 為 $-Z^2Q$ 。

實施例 90. 實施例 63 的化合物，其中當 Z 為直接鍵時，J 為 $C(=W^2)NTAT^B$ 。

實施例 91. 式 1 或實施例 1 至 90 中任一者的化合物，其中當 J 為 $C(W^2)NTAT^B$ 時，J 選自示例 4 中 J-83 至 J-93。

5

示例 4



實施例 96. 式 1 或實施例 1 至 95 中任一者的化合物，其中每個 R^{19} 在單獨出現時（即非與 R^{16} 一起出現）時獨立地為鹵素或 C_1-C_3 烷基。

5 實施例 97. 式 1 或實施例 1 至 96 中任一者的化合物，其中 R^{16} 在單獨出現時（即非與 R^{19} 一起出現）時為 H 或 C_1-C_3 烷基。

實施例 98. 實施例 97 的化合物，其中 R^{16} 在單獨出現時為 H 或甲基。

10 實施例 99. 式 1 或實施例 1 至 98 中任一者的化合物，其中當 R^{16} 和 R^{19} 與它們連接的原子一起形成 3-至 7-員環時，所述環含有選自碳原子和最多 2 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 2 個 N，其中最多 2 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，而硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，並且該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、羥基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代。

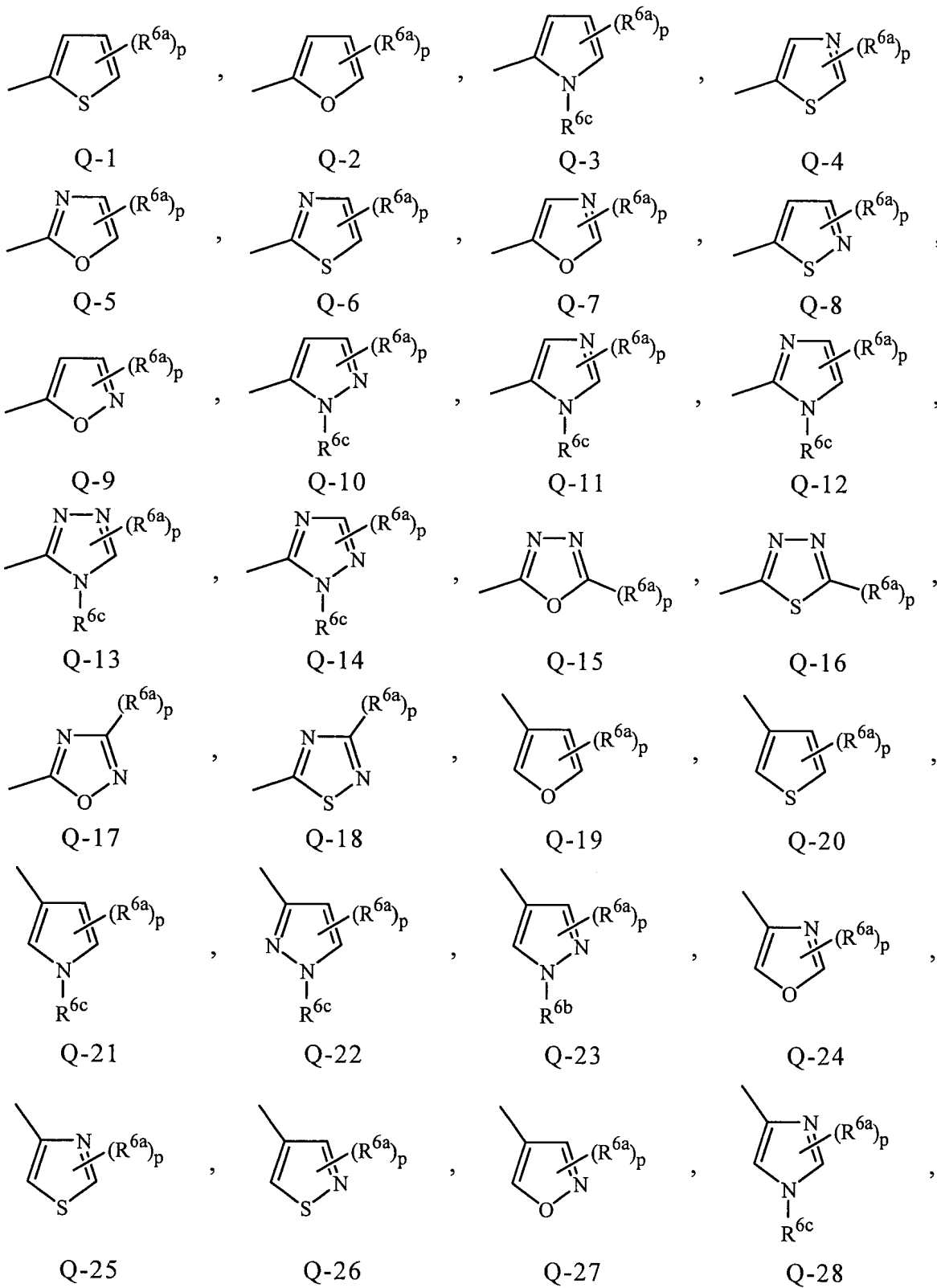
15 20 25 實施例 100. 式 1 或實施例 1 至 99 中任一者的化合物，其中每個 Q 獨立地為苯基、苜基、萘基、5-至 6-員雜芳環或 8-至 11-員雜芳族雙環系統，每個的碳和氮原子環員上任選經最多 1 個選自 R^{6b} 的取代基取代，最多 5 個獨立選自碳原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的 C_1-C_3 烷

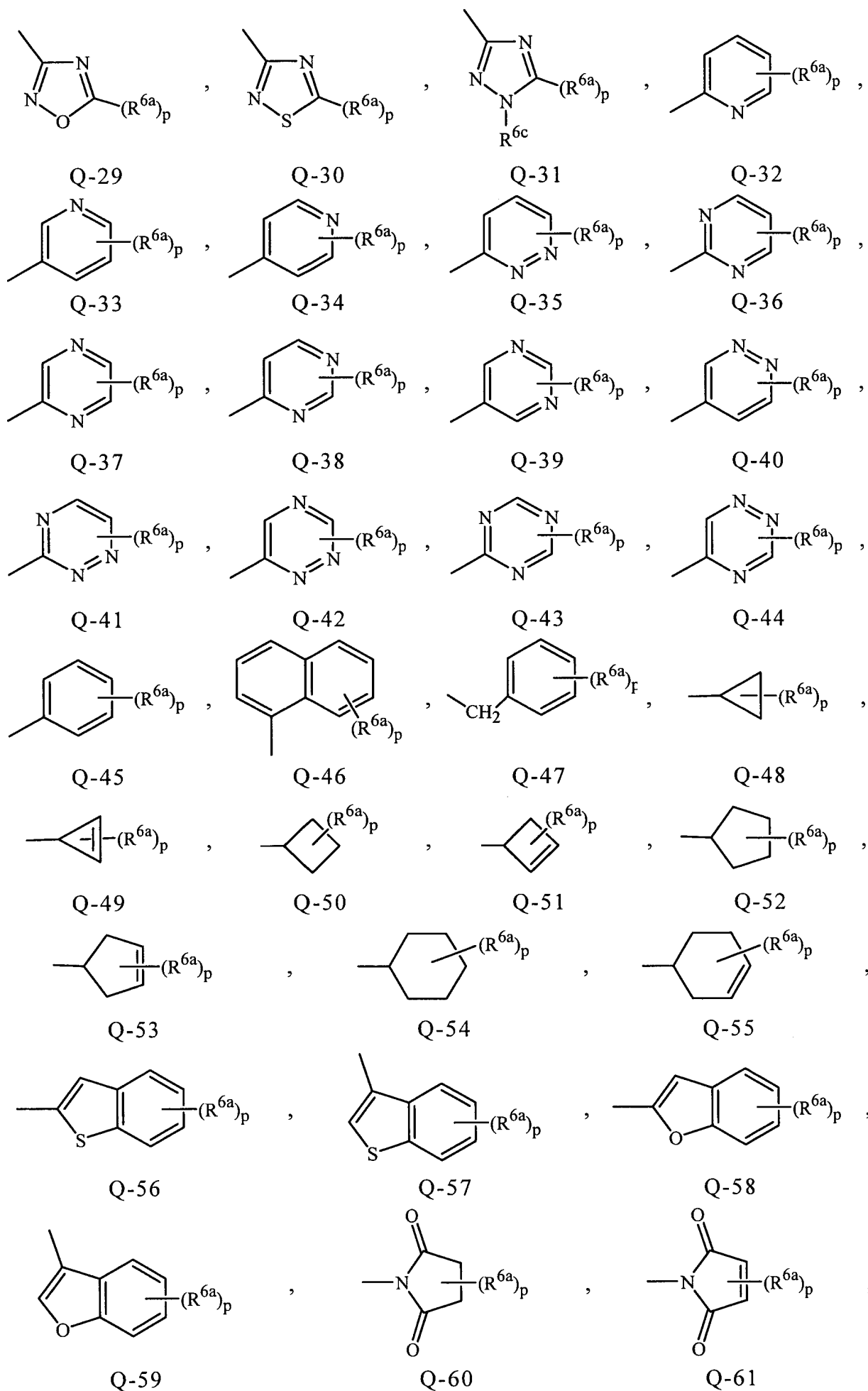
基、C₂-C₃ 烷基羰基、C₂-C₃ 烷氧基羰基或 C₁-C₃ 烷氧基的取代基；或

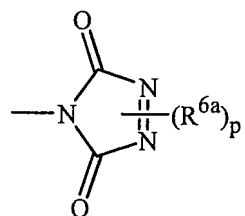
3-至 7-員非芳族碳環、5-至 7-員非芳族雜環或
8-至 11-員非芳族雙環系統，每個環或環系統
含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所
述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、
最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 3
個碳原子環員獨立選自 C(=O)和 C(=S)，硫原
子環員獨立選自 S(=O)_s(=NR¹¹)_f，而矽原子環
員獨立選自 SiR⁹R¹⁰，每個環或環系統任選經
最多 1 個選自碳和氮原子環員上的 R^{6b} 的取代
基取代，最多 5 個獨立選自碳原子環員上的
R^{6a} 和氮原子環員上的 C₁-C₃ 烷基、C₂-C₃ 烷基
羰基、C₂-C₃ 烷氧基羰基和 C₁-C₃ 烷氧基的取代
基。

實施例 101. 實施例 100 的化合物，其中 Q 為選自
Q-1 至 Q-102 的環，如下面示例 5 中所示。

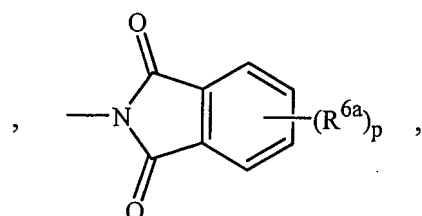
示例 5



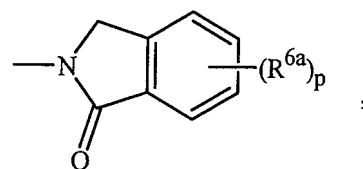




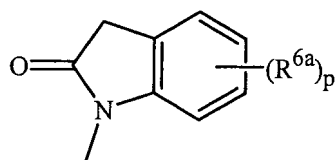
Q-62



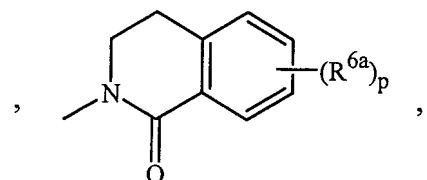
Q-63



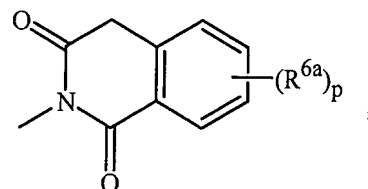
Q-64



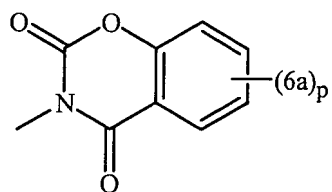
Q-65



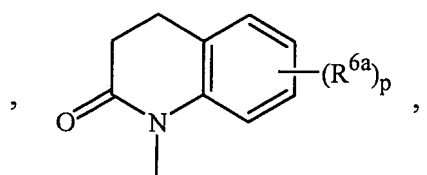
Q-66



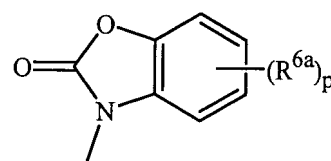
Q-67



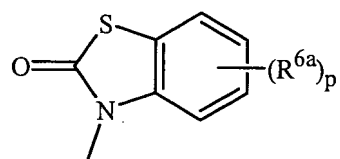
Q-68



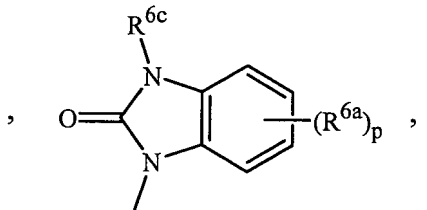
Q-69



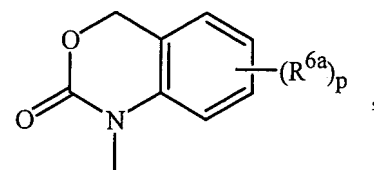
Q-70



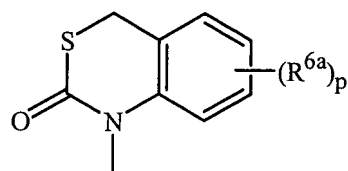
Q-71



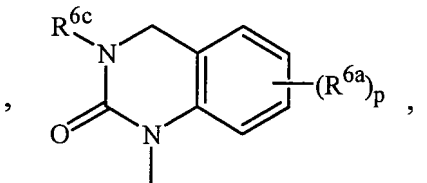
Q-72



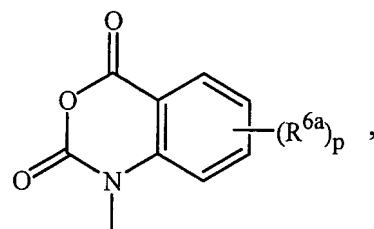
Q-73



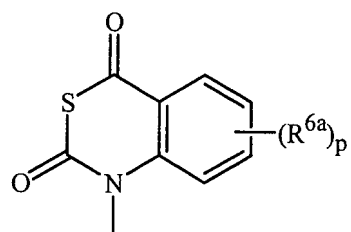
Q-74



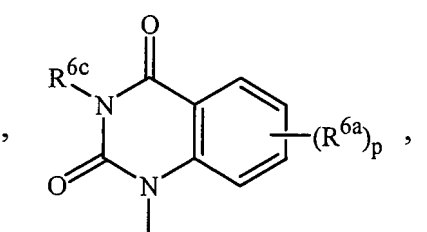
Q-75



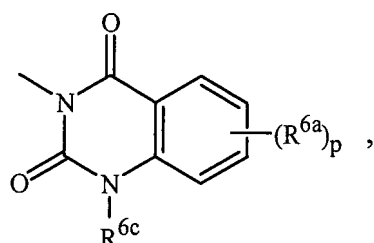
Q-76



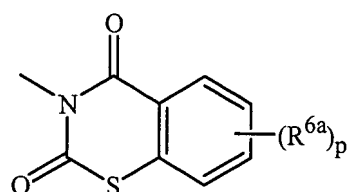
Q-77



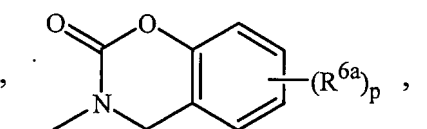
Q-78



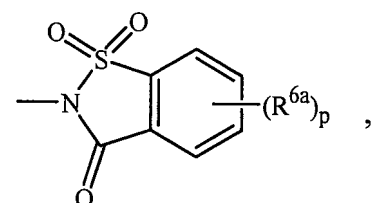
Q-79



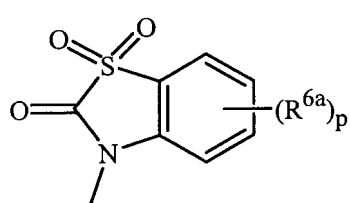
Q-80



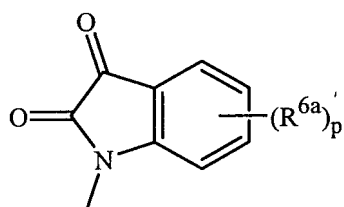
Q-81



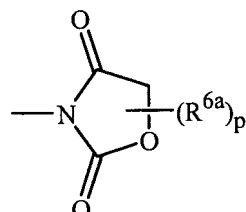
Q-82



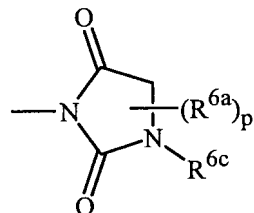
Q-83



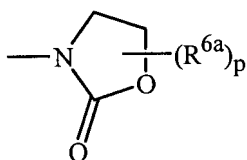
Q-84



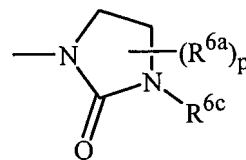
Q-85



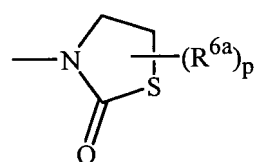
Q-86



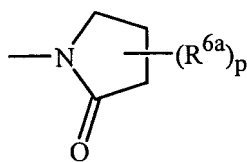
Q-87



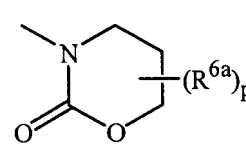
Q-88



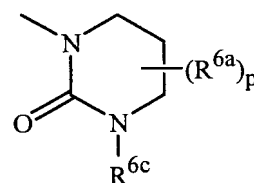
Q-89



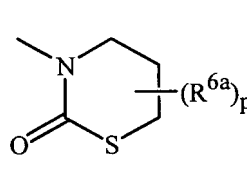
Q-90



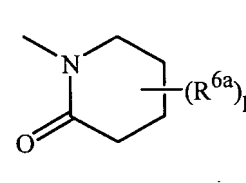
Q-91



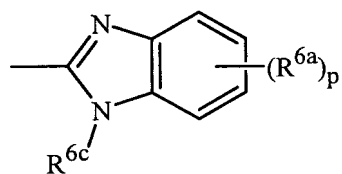
Q-92



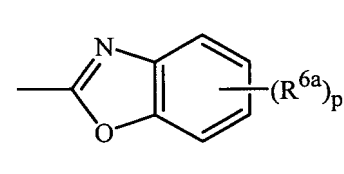
Q-93



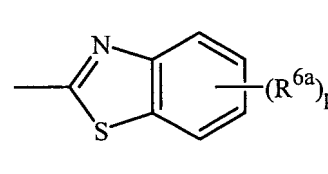
Q-94



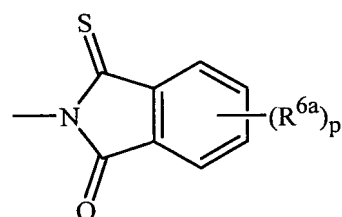
Q-95



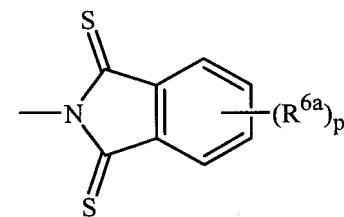
Q-96



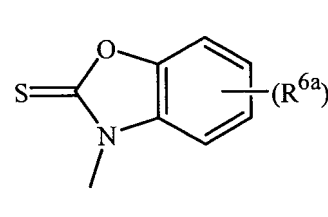
Q-97



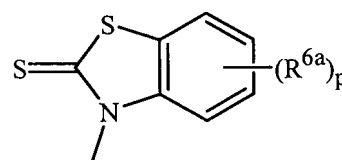
Q-98



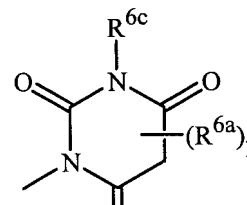
Q-99



Q-100



Q-101



Q-102

其中向左伸出的鍵連接至式 1 的 Z^2 ；並且每個 R^{6c} 獨立選自 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烷基羰基、 C_2 - C_3 烷氧基羰基和 C_1 - C_3 烷氧基；p 為 0 至 5 的整數；而 g 為 0 至 1 的整數。

5 實施例 102. 實施例 101 的化合物，其中 p 為 0、1、2 或 3。

實施例 102a. 實施例 101 的化合物，其中 p 為 0、1 或 2。

10 實施例 102b. 實施例 101 的化合物，其中 p 為 1 或 2。

實施例 103. 實施例 101 至 102b 中任一者的化合物，其中 Q 選自 Q-1、Q-20、Q-32 至 Q-34、Q-45 至 Q-47、Q-60 至 Q-73、Q-76 至 Q-79、Q-84 至 Q-94 和 Q-98 至 Q-102。

15 實施例 104. 實施例 103 的化合物，其中 Q 選自 Q-1、Q-45、Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、Q-69、Q-70、Q-71、Q-72、Q-73、Q-76、Q-78、Q-79、Q-84、Q-85、Q-98、Q-99、Q-100、Q-101 和 Q-102。

20 實施例 105. 實施例 104 的化合物，其中 Q 選自 Q-45、Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、Q-69、Q-70、Q-71、Q-72、Q-84 和 Q-85。

25 實施例 106. 實施例 105 的化合物，其中 Q 選自 Q-45、Q-63、Q-65、Q-70、Q-71、Q-72、Q-84 和 Q-85。

實施例 107. 實施例 106 的化合物，其中 Q 選自 Q-45、Q-63、Q-65、Q-70、Q-71、Q-72 和 Q-84。

實施例 107a. 實施例 107 的化合物，其中 Q 選自 Q-45、Q-63、Q-70、Q-71、Q-72 和 Q-84。

5 實施例 108. 式 1 或實施例 1 至 107 中任一者的化合物，其中每個 R^{6a} 在單獨出現時（即沒有與 R^6 一起使用時）獨立地為鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基或 C_1-C_3 鹵烷氧基。

10 實施例 108a. 實施例 108 的化合物，其中每個 R^{6a} 在單獨出現時獨立地為鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基或 C_1-C_2 鹵烷氧基。

15 實施例 108b. 實施例 108a 的化合物，其中每個 R^{6a} 在單獨出現時獨立地為鹵素、羥基、氰基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基或 C_1-C_2 烷氧基。

實施例 108c. 實施例 108b 的化合物，其中每個 R^{6a} 在單獨出現時獨立地為鹵素、羥基、氰基、 C_1-C_2 烷基或 C_1-C_2 烷氧基。

20 實施例 108d. 實施例 108c 的化合物，其中每個 R^{6a} 在單獨出現時獨立地為 F、Cl、Br、羥基、氰基、甲基或甲氧基。

實施例 108e. 實施例 108c 的化合物，其中每個 R^{6a} 在單獨出現時為 F。

25 實施例 108f. 實施例 108c 的化合物，其中每個 R^{6a} 在單獨出現時為氰基或甲基。

實施例 109. 式 1 或實施例 1 至 108f 中任一者的化合物，其中每個 R^{6a} 為單獨出現。

5 實施例 111. 式 1 中任一者或實施例 1 至 109 中任一者的化合物，其中當 R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成環時，所述環為 5-至 6-員環並且含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，並且該環任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基和氮原子環員上的 C_1-C_2 烷基的取代基取代。

10 實施例 112. 實施例 111 的化合物，其中當 R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成環時，該環含有選自碳原子和最多 1 個雜原子的環員，所述雜原子選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，並且所述環的碳原子環員上任選被最多 1 個獨立選自鹵素、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代。

20 本發明的實施例（包括上面的實施例 1-112 以及本文描述的任何其他實施例）可以以任何方式組合，並且實施例中的改變的描述不僅涉及包含式 1 化合物的組合物，而且還涉及式 1 化合物、可用於製備式 1 化合物的起始化合物和中間化合物，除非在實施例中有另外說明。另外，本發明的實施例（包括上面的實施例 1-112
25 以及本文描述的任何其他實施例）及其組合涉及本發明

的組合物和方法。實施例 1-112 的組合可通過如下進行說明：

實施例 A1. 式 1 化合物，其中

A 為 -O-、-S- 或 -N(R⁷)-；

G 為 5 員雜環，任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的 R²⁶ 和氮原子環員上的 R²⁷ 的取代基取代；

每個 R²⁶ 獨立地為鹵素、C₁-C₃ 烷基或 C₁-C₃ 鹵烷基；

每個 R²⁷ 獨立地為 C₁-C₃ 烷基；

Z 為直接鍵、CH(R¹²) 或 N(R¹³)；

J 為 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 與最多 4 個 N，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 C(=O) 和 C(=S)，硫原子環員獨立選自 S(=O)_s(=NR¹¹)_f，每個環或環系統任選經最多 5 個獨立選自 R⁶ 取代基取代；或者當 Z 為直接鍵時，J 也為 C(=W²)NT^AT^B；

X 為 X¹、X²、X³、X⁴、X⁵、X⁶、X⁷ 或 X⁸；

R¹ 為 H、氰基、C₁-C₄ 烷基、C₂-C₄ 烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₄ 鹵烷基、C₂-C₄ 鹵烯基、C₂-C₄ 鹵炔基、C₂-C₄ 烷氧基烷基、C₂-C₄ 烷硫

基烷基、C₂-C₄ 烷基羰基、C₂-C₄ 鹵烷基羰基、C₂-C₄ 烷氧基羰基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 鹵烷氧基、C₂-C₄ 烯氧基、C₂-C₄ 鹵烯氧基、C₂-C₄ 炔氧基、C₃-C₄ 鹵炔氧基、C₂-C₄ 烷氧基烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 鹵烷硫基、C₁-C₄ 烷基胺基、C₂-C₄ 二烷基胺基、C₁-C₄ 鹵烷基胺基或 C₂-C₄ 鹵二烷基胺基；

R² 為 H、C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 烷氧基或 C₁-C₃ 鹵烷基；或者

R¹ 和 R² 與它們連接的碳原子一起形成 3-至 6-員環，所述環含有選自碳原子和最多 2 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 2 個 N，其中最多 1 個碳原子環員為 C(=O) 或 C(=S) 且該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₁-C₂ 烷氧基和 C₁-C₂ 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 烷氧基的取代基取代；

R³ 為經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環；或 H、氰基、羥基、C₁-C₃ 烷基、C₂-C₃ 烯基、C₂-C₃ 炔基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₂-C₃ 鹵烯基、C₂-C₃ 鹵炔基、C₂-C₃ 烷基羰基、

C₂-C₃ 鹵烷基羰基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基、C₁-C₃ 烷硫基、C₁-C₃ 鹵烷硫基、C₂-C₃ 烷基羰基氧基或 C₂-C₃ 鹵烷基羰基氧基；

5 R⁴ 為 H 或 C₁-C₂ 烷基；

每個 R⁵ 獨立地為鹵素、氰基、羥基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基或 C₁-C₂ 烷氧基；

10 R⁶ 獨立地為 H、鹵素、氰基、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基、C₂-C₆ 炔基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₂-C₆ 鹵烯基、C₂-C₆ 鹵炔基、C₃-C₈ 環烷基、C₃-C₈ 鹵環烷基、C₄-C₁₀ 烷基環烷基、C₄-C₁₀ 環烷基烷基、C₂-C₆ 烷氧基烷基、C₄-C₁₀ 環烷氧基烷基、C₃-C₈ 烷氧基烷氧基烷基、C₂-C₆ 烷硫基烷基、C₂-C₆ 烷氧基羰基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、C₃-C₈ 環烷氧基、C₃-C₈ 鹵環烷氧基、C₄-C₁₀ 環烷基烷氧基、C₂-C₆ 烯氧基、C₂-C₆ 鹵烯氧基、C₂-C₆ 炔氧基、C₂-C₆ 鹵炔氧基、C₂-C₆ 烷氧基烷氧基、C₂-C₆ 烷基羰基氧基、C₂-C₆ 鹵烷基羰基氧基、C₄-C₈ 環烷基羰基氧基、C₃-C₆ 烷基羰基烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 鹵烷硫基、C₃-C₈ 環烷硫基、C₃-C₁₀ 三烷基矽烷基、-NR¹⁷R¹⁸ 或 -Z²Q；

25 每個 Z² 獨立地為直接鍵、O、C(=O)、S(=O)₂ 或 CH(R₁₂)；

每個 Q 獨立地為苯基、苄基、萘基、5-至 6-員雜芳環或 8-至 11-員雜芳族雙環系統，各任選經最多 1 個選自碳和氮原子環員上的 R^{6b} 的取代基取代，最多 5 個獨立選自碳原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烷基羰基、 C_2 - C_3 烷氧基羰基或 C_1 - C_3 烷氧基的取代基；或 3-至 7-員非芳族碳環、5-至 7-員非芳族雜環或 8-至 11-員非芳族雙環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而矽原子環員獨立選自 SiR^9R^{10} ，每個環或環系統任選經最多 1 個選自碳和氮原子環員上的 R^{6b} 的取代基取代，最多 5 獨立選自碳原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烷基羰基、 C_2 - C_3 烷氧基羰基和 C_1 - C_3 烷氧基的取代基；

每個 R^{6a} 獨立地為鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_1 - C_3 烷氧基或 C_1 - C_3 鹵烷氧基；或者

R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成 5-至 6-員環，所述環含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，所述環任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基和氮原子環員上的 C_1 - C_2 烷基的取代基取代；

R^7 為 H、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 $CH_3C(=O)$ 、 $CF_3C(=O)$ 或 $CH_3OC(=O)$ ；
或者

R^2 和 R^7 與它們連接的相連原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環，除相連原子外，該環還含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，所述環任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基和 C_1 - C_2 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基的取代基取代；

每個 R^{13} 獨立為 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烷基羰基或 C_2 - C_3 烷氧基羰基；

每個 R^{18} 獨立地為 C_1 - C_3 烷基或 $-Z^3Q$ ；並且

每個 Z^3 獨立地為 $C(=O)$ 或 $S(=O)_2$ 。

實施例 A2. 實施例 A1 的化合物，其中

A 為 -O- 或 -N(R⁷)- ；

G 為示例 2 中示出的 G-1 至 G-59 中的一者，
其中向左伸出的鍵連接至 X，而向右伸
出的鍵連接至式 1 中的 Z ；

5 每個 R^{26a} 獨立選自 H 和 R²⁶ ；

R^{27a} 選自 H 和 R²⁷ ；

Z 為直接鍵 ；

J 為示例 3 中示出的 J-1 至 J-82 中的一者，
其中浮動鍵透過任何和所述環或環系
統中的可用碳或氮原子連接至式 1 中的
Z ；

X 為 1 至 5 的整數 ；

當 X 為 2、3、4 或 5 時，則最多一 R⁶ 的例
子為 -Z²Q ；或者

15 J 為 C(=W²) NT^AT^B ；

W² 為 O ；

X 為 X¹、X² 或 X³ ；

R¹ 為 H、氰基、C₁-C₃ 烷基、C₂-C₃ 烯基、C₂-C₃
炔基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₂-C₃ 鹵烯基、C₂-C₃
鹵炔基、C₁-C₃ 烷氧基或 C₁-C₃ 鹵烷氧
基 ；

R² 為 H、C₁-C₃ 烷基或 C₁-C₃ 鹵烷基 ；

R³ 為苯基、萘基或 5-或 6-員雜芳環，每個環
或環系統任選經最多 3 個獨立選自碳原
子環員上的 R^{25a} 和氮原子環員上的 R^{25b}
的取代基取代；或 H、氰基、羥基、C₁-C₃

烷基、C₂-C₃ 烯基、C₂-C₃ 炔基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₂-C₃ 鹵烯基、C₂-C₃ 鹵炔基、C₂-C₃ 烷基羰基、C₂-C₃ 鹵烷基羰基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基、C₁-C₃ 烷硫基、C₁-C₃ 鹵烷硫基、C₂-C₃ 烷基羰基氧基或 C₂-C₃ 鹵烷基羰基氧基；

每個 R^{25a} 獨立地為鹵素、氰基、羥基、胺基、硝基、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基、C₂-C₆ 炔基、C₃-C₆ 環烷基、C₄-C₁₀ 環烷基烷基、C₄-C₁₀ 烷基環烷基、C₅-C₁₀ 烷基環烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₂-C₆ 鹵烯基、C₂-C₆ 鹵炔基、C₃-C₆ 鹵環烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 鹵烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 烷基亞磺醯基、C₁-C₄ 烷基磺醯基、C₁-C₄ 鹵烷硫基、C₁-C₄ 鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₄ 鹵烷基磺醯基、C₁-C₄ 烷基胺基、C₂-C₈ 二烷基胺基、C₃-C₆ 環烷基胺基、C₂-C₄ 烷氧基烷基、C₁-C₄ 羥烷基、C₂-C₄ 烷基羰基、C₂-C₆ 烷氧基羰基、C₂-C₆ 烷基羰基氧基、C₂-C₆ 烷基羰基硫基、C₂-C₆ 烷基胺基羰基、C₃-C₈ 二烷基胺基羰基或 C₃-C₆ 三烷基矽烷基；

每個 R^{25b} 獨立地為 C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 烯基、C₃-C₆ 炔基、C₃-C₆ 環烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₃-C₆ 鹵烯基、C₃-C₆ 鹵炔基、C₃-C₆ 鹵環烷基或 C₂-C₄ 烷氧基烷基；

每個 R^5 獨立地為氰基、甲基或甲氧基；

每個 R^6 獨立地為 H、氰基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_3 - C_8 環烷基、 C_3 - C_8 鹵環烷基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基、 C_3 - C_8 環烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 鹵烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷氧基、 C_2 - C_6 烷基羰基氧基、 C_2 - C_6 鹵烷基羰基氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 鹵烷硫基、 C_3 - C_{10} 三烷基矽烷基、 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；

每個 Z^2 為直接鍵；

Q 為示例 5 中示出的 Q-1 至 Q-102 中的一者，其中向左伸出的鍵連接至式 1 中的 Z^2 ；

每個 R^{6c} 獨立選自 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烷基羰基、 C_2 - C_3 烷氧基羰基和 C_1 - C_3 烷氧基；

p 為 0 至 5 的整數；

g 為 0 至 1 的整數；

每個 R^{6a} 獨立地為鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基；或

R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成經任選取代的 5-至 6-員環，所述環含有選自碳原子和最多 1 個雜原子的環員，所述雜原子選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最

多 1 個 N 原子，所述環的碳原子環員任選經最多 1 個獨立選自鹵素、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 烷氧基的取代基取代；

R⁷ 為 H 或 C₁-C₂ 烷基；或

R² 和 R⁷ 與它們連接的相連原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環，除了相連原子外，所述環還含有選自碳的環員，所述環任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的 C₁-C₂ 烷基。

每個 R¹⁸ 獨立地為 C₁-C₃ 烷基；並且 n 為 0 或 1。

實施例 A3. 實施例 A2 的化合物，其中

W 為 O；

G 選自 G-1、G-2、G-7、G-8、G-14、G-15、G-23、G-24、G-26、G-27、G-36、G-37、G-38、G-49、G-50 和 G-55；

x 為 1、2 或 3；

J 選自 J-1、J-2、J-3、J-4、J-5、J-7、J-8、J-9、J-10、J-11、J-12、J-14、J-15、J-16、J-20、J-24、J-25、J-26、J-29、J-30、J-37、J-38、J-45 和 J-69；或

J 為示例 4 中示出的 J-83 至 J-91 中的一者，其中向左伸出的鍵連接至 X，而向右伸出的鍵連接至式 1 中的 G，用星號(*)標識的碳原子具有立構中心；

每個 R^6 獨立地為 H、氰基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；

每個 R^{28a} 獨立選自鹵素、羥基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基並且連接至碳環員；

R^{28b} 選自鹵素、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基；

每個 j 和 p 獨立地為 0、1 或 2；

X 為 X^1 或 X^2 ；

R^1 為 H、 C_1-C_3 烷基或 C_1-C_3 氟烷基；

R^2 為 H、 C_1-C_2 烷基或 C_1-C_3 氟烷基；

R^3 為示例 1 中示出的 U-1 至 U-11 中的一者其中向左伸出的鍵連接至式 1；

k 為 0、1 或 2；或者

R^3 為 H、氰基、羥基、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 鹵烷硫基、 C_2-C_3 烷基羰基氧基或 C_2-C_3 鹵烷基羰基氧基；

Q 選自 Q-1、Q-20、Q-32 至 Q-34、Q-45 至 Q-47、Q-60 至 Q-73、Q-76 至 Q-79、Q-84 至 Q-94 和 Q-98 至 Q-102；

每個 R^{6a} 獨立地為鹵素、羥基、氰基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基或 C_1-C_2 烷氧基；以及

R^7 為 H 或甲基。

實施例 A4. 實施例 A3 的化合物，其中

A 為 -O-

G 選自 G-1、G-2、G-15、G-26、G-27、G-36、
G-37 和 G-38；

J 選自 J-4、J-5、J-8、J-11、J-15、J-16、J-20、
J-29、J-30、J-37、J-38 和 J-69；

X 為 X^1 ；

R^1 為 H、甲基、三氟甲基或 CF_3CH_2 ；

R^2 為 H、甲基或三氟甲基；

R^3 為 H、氟基、甲基、甲氧基或 $CH_3C(=O)O-$ ；

R^4 為 H；

每個 R^6 獨立地為 H、氟基、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；

Q 選自 Q-1、Q-45、Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、
Q-69、Q-70、Q-71、Q-72、Q-73、Q-76、
Q-78、Q-79、Q-84、Q-85、Q-98、Q-99、
Q-100、Q-101 和 Q-102；

每個 R^{6a} 獨立地為鹵素、羥基、氟基、 C_1-C_2 烷基或 C_1-C_2 烷氧基；並且

n 為 0。

實施例 A5. 實施例 A4 的化合物，其中

G 選自 G-1、G-2、G-15、G-26 和 G-36；

x 為 1 或 2；

J 選自 J-4、J-5、J-11、J-20、J-29、J-37、J-38
和 J-69；

R^1 為甲基、三氟甲基或 CF_3CH_2 ；

R^3 為 H；

每個 R^6 獨立地為 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵
烷基或 $-Z^2Q$ ；

Q 選自 Q-45、Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、
5 Q-69、Q-70、Q-71、Q-72、Q-84 和 Q-85；

並且

每個 R^{6a} 獨立地為 F、Cl、Br、羥基、氰基、
甲基或甲氧基。

實施例 A6. 實施例 A5 的化合物，其中

10 G 為 G-1；

x 為 1；

J 為 J-29；

R^6 為 $-Z^2Q$ ；並且

15 Q 選自 Q-45、Q-63、Q-70、Q-71、Q-72 和
Q-84。

實施例 A7. 實施例 A6 的化合物，其中

20 Q 為 Q-45；

p 為 1 或 2；並且

每個 R^{6a} 為 F。

實施例 A8. 實施例 A6 的化合物，其中

Q 為 Q-45；

p 為 1；並且

每個 R^{6a} 為氰基或甲基。

具體的實施例包括選自以下化合物的式 1 化合物：

2,2,2-三氟乙醛 2-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二
 氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙
 基]-2-甲基脞；

2-[4,5-二氫-3-[2-[1-[2-[(2,2,2-三氟亞乙基)胺基]氧
 基]乙醯基]-4-哌啶基]-4-噻唑基]-5-異噁唑基]苄腈；

2,2,2-三氟乙醛 *O*-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二
 氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]
 脞；

1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-
 噻唑基]-1-哌啶基]-2-[4,5-二氫-3-(三氟甲基)-1*H*-吡
 唑基-1-基]乙酮；

1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-
 噻唑基]-1-哌啶基]-2-[4,5-二氫-5-甲基-3-(三氟甲
 基)-1*H*-吡唑-1-基]乙酮；

1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-
 噻唑基]-1-哌啶基]-2-[4,5-二氫-5,5-二甲基-3-(三氟
 甲基)-1*H*-吡唑-1-基]乙酮；

2,2,2-三氟乙醛，*O*-[2-[4-[4-(2,3-二氫螺[1*H*-茛
 -1,5'(4'*H*)-異噁唑]-3'-基)-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側
 氧乙基]脞；

2,2,2-三氟乙醛，*O*-[2-[4-[4-[4,5-二氫-5-(2-側氧
 (2*H*)-苯并噁唑基)-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶
 基]-2-側氧乙基]脞；和

1,1,1-三氟-2-丙酮，*O*-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯
 基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-
 側氧乙基]脞；

2-丙酮, *O*-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基] 脞;

2-[4,5-二氫-3-[2-[1-[2-[[2,2,2-三氟-1-甲基亞乙基)胺基]氧基]乙醯基]-4-哌啶基]-4-噻唑基]-5-異噁唑基] 苜脞;

1,1,1-三氟-2-丙酮, *O*-[2-[4-[4-[4,5-二氫-5-(2-側氧-3-(2*H*)-苯并噁唑基)-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基] 脞; 以及

2-丙酮, *O*-[2-[4-[4-[5-(1,3-二氫-1,3-二側氧-2*H*-異吡啶-2-基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基] 脞。

值得注意的式 1 化合物包括它們的幾何異構體和立體異構體、互變異構體、*N*-氧化物及其鹽 (包括但不限於上述的實施例 1-112 與 A1-A6) 其中 R² 為 H、鹵素、氰基、羥基、C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₁-C₃ 烷氧基或 C₁-C₃ 鹵烷氧基。

值得注意的式 1 化合物亦包括它們的幾何異構體和立體異構體、互變異構體、*N*-氧化物及其鹽 (包括但不限於上述的實施例 1-112 與 A1-A6) 其中每個連接至相同碳原子的 R³ 與 R⁴ 為單獨出現 (即非一起形成一飽和碳環)。

值得注意的式 1 化合物進一步包括它們的幾何異構體和立體異構體、互變異構體、*N*-氧化物及其鹽 (包括但不限於上述的實施例 1-112 與 A1-A6) 其中 R¹⁵ 為苯基、苜基、萘基或 5-至 6-員雜芳環, 各任選經最多 3 個獨立選自 R¹⁹ 的取代基取代。

值得注意的式 1 化合物尤其包括它們的幾何異構體和立體異構體、互變異構體、*N*-氧化物及其鹽（包括但不限於上述的實施例 1-112 與 A1-A6）其中 R^2 和 R^7 與它們連接的連接原子一起形成 5-至 7-員環，除了連接原子外，該環還含有選自如下的環員：碳原子和最多 3 個獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子的雜原子，該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基和 C_1 - C_2 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基的取代基取代。

本發明提供了包含選自式 1（包括所有幾何異構體和立體異構體）、它們的互變異構體、*N*-氧化物及其鹽的化合物和至少一種其他殺真菌劑的殺真菌組合物。值得注意的是，這類組合物的實施例是包含對應上述任一化合物實施例的化合物的組合物。

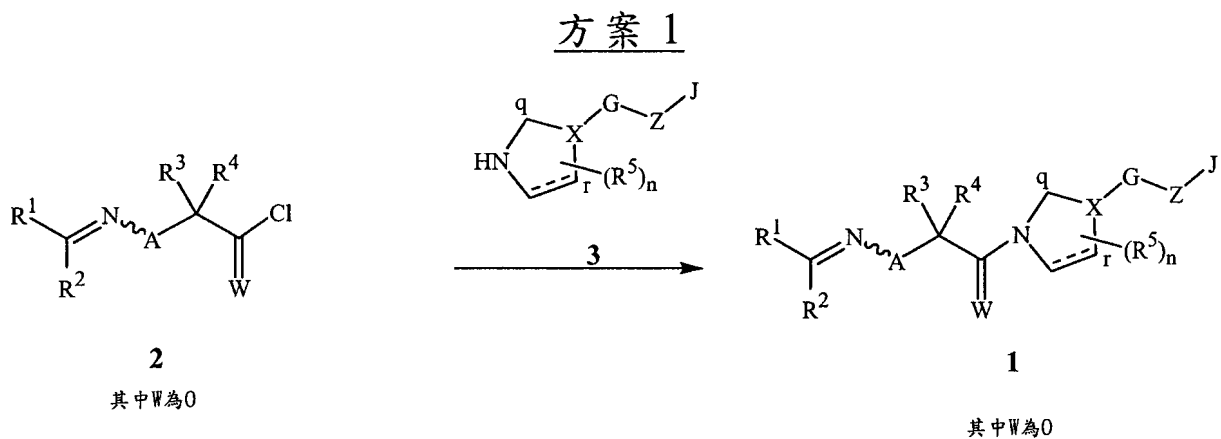
本發明提供了殺真菌組合物，所述組合物包含殺真菌有效量的選自式 1（包括所有幾何異構體和立體異構體、它們的互變異構體、*N*-氧化物及其鹽的化合物）（在一殺真菌有效量上），以及至少一種選自表面活性劑、固體稀釋劑和液體稀釋劑的另外的組分。值得注意的是，這類組合物的實施例是包含對應上述任一化合物實施例的化合物的組合物。

本發明提供了用於控制由真菌植物病原體引起的植物病害的方法，所述方法包括向植物或其部分或者向植物種子施用殺真菌有效量的化合物，所述化合物選自式 1（包括所有幾何異構體和立體異構體、它們的互變

異構體、*N*-氧化物及其鹽)。值得注意的是，這種方法的實施例是包括施用殺真菌有效量的對應上述任何化合物實施例的化合物的方法。特別值得注意的是其中化合物作為本發明組合物施用的實施例。

5 一種或多種下面方案 1-20 中描述的方法和變型形式可用於製備式 1 化合物。下面的式 1-40 化合物中的 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、A、G、J、W、TA, TB、W、 W^2 、X、Z、和 n 的定義與上文「發明內容」中的定義相同，除非另外指明。式 1a 和式 1b 的化合物是式 1 的子集，並且式 1a 和式 1b 的所有取代基是如上文對式 1 的定義，除非另有註明。

10 如在方案 1 中所示，其中 W 為 O 的式 1 化合物可以通過將式 2 的醯基氯與式 3 的胺（或其酸性鹽）在存在酸清除劑的情況下偶聯而製備。典型的酸清除劑包括胺鹼例如三乙胺、*N,N*-二異丙基乙胺和吡啶。其他酸清除劑包括氫氧化物例如氫氧化鈉和氫氧化鉀，以及碳酸鹽例如碳酸鈉和碳酸鉀。在某些情況下，有益的是使用聚合物-負載的酸清除劑，例如聚合物-鍵合的 *N,N*-二異丙基乙胺和聚合物-鍵合的 *N,N*-二甲基-4-吡啶胺。式 3 的胺的酸性鹽也可用於該方法，前提條件是存在至少 2 當量的酸清除劑。通常用於與胺形成鹽的酸包括鹽酸、草酸和三氟乙酸。



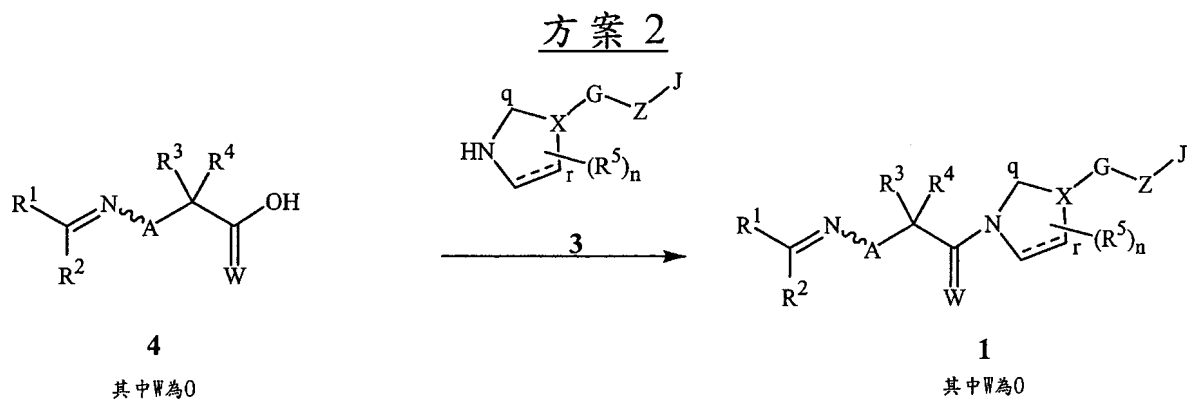
5 在後續步驟中，採用多種標準硫雜化試劑如五硫化二磷或 2,4-雙(4-甲氧苯基)-1,3-二硫雜-2,4-二磷雜環丁烷-2,4-二硫化物(拉韋松試劑(Lawesson's reagent))，可將其中 W 為 O 的式 1 化合物轉化成其中 W 為 S 的相應硫醯胺。

10 如方案 2 中所示，在可供選擇的方法中，其中 W 為 O 的式 1 化合物可通過使式 4 的酸與式 3 的胺(或其酸性鹽)在存在去水偶聯劑如二環-己基碳二亞胺(DCC)、1-(3-二甲基胺丙基)-3-乙基碳二醯亞胺鹽酸鹽(EDC)或 O-苯并三唑-1-基-N,N,N',N'-四甲基尿六氟磷酸鹽(HBTU)的情況下偶聯而製備。聚合物-負載的試劑是可用的，例如聚合物-鍵合的環己基碳二醯亞胺。這些反應通常在 0-40°C 下於溶劑如二氯甲烷或乙腈中，並且在存在鹼如三乙胺或 N,N-二異丙基乙胺的情況下進行。

15 式 4 的起始酸是已知的或者可通過本領域技術人員已知的方法製備。對於主要的參考文獻，參見例如 Schumann 等人，*Journal of Medicinal & Pharmaceutical*

20

Chemistry 1962, 5, 464-77; Van Dijk 等人, *Journal of Medicinal Chemistry* 1977, 20(9), 1199-206; A. Balsamo 等人, *Journal of Medicinal Chemistry* 1989, 32, 1398-1401, 和美國專利第 4,584,014 號。式 4 的酸對於
 5 製備用於方案 1 方法的式 2 酸氯化物為有用的中間體。
 可使用於轉換酸成為酸氯化物的各式熟知條件係公開於化學文獻中。



10

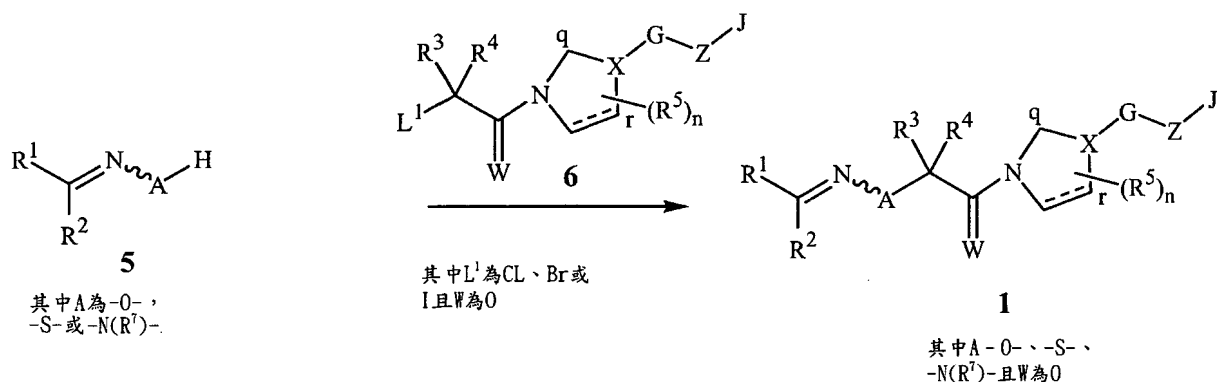
由於綜合性文獻包括許多種形成醯胺鍵的方法，所以方案 1 和 2 中的方法只是可用於製備式 1 化合物的各種各樣的方法中的簡單代表性實例。

15

在一替代性方法中，其中 A 為 -O-、-S- 和 -N(R⁷)- 且 W 為 O 的式 1 化合物可通過如方案 3 中所示使式 5 化合物與式 6 的鹵乙醯胺反應製備。該反應在存在鹼如氫化鈉或碳酸鉀以及溶劑如四氫呋喃、N,N-二甲基甲醯胺或乙腈的情況下通常在 0 至 80 °C 的溫度間進行。

20

方案 3

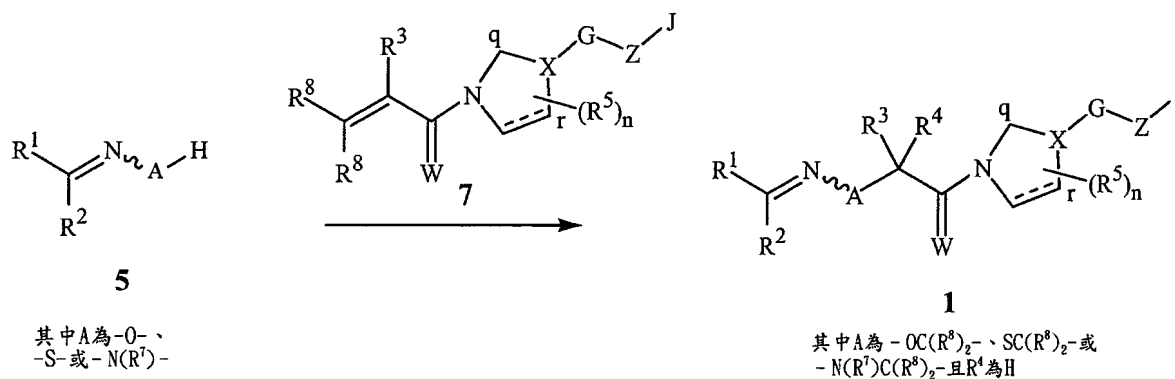


式 5 的亞胺、脞和脞是已知的並且可通過本領域已
 知的方法製備；參見例如 S. Dayagi 等人，*The Chemistry*
 5 *of the Carbon-Nitrogen Double Bond*, S. Patei (編輯)，
 Interscience, New York 1970；S.R. Sandler 等人，*Organic*
Functional Group Preparations, Academic Press, New
 York 1972, 3, 372 和 G. Hilgetag 等人，*Preparative*
 10 *Organic Chemistry*, John Wiley & Sons, New York 1972,
 504-515。式 6 的鹵乙醯胺可通過讓式 3 的胺與 α -鹵羧
 酸鹵化物或 α -鹵羧酸（或其酸酐）反應而製備，使用的
 條件與描述用於方案 1 或 2 中的醯胺形成反應者類似。

式 1 化合物（其中 A 為 $-\text{OC}(\text{R}^8)_2-$ 、 $-\text{SC}(\text{R}^8)_2-$ 或
 $-\text{N}(\text{R}^7)\text{C}(\text{R}^8)_2-$ ，並且 R^4 為 H）可如方案 4 所示，通過式
 15 5 化合物與式 7 的 $\alpha\beta$ -不飽和醯胺的鹼催化縮合反應製
 備，其中式 5 中的 A 和式 7 中的 $\text{C}(\text{R}^8)_2$ 形成式 1 中的 A。
 該反應通常是在 0 至 80 °C 間的溫度，在存在鹼如氫氧
 化鈉或氫氧化鉀、氫化鈉或碳酸鉀的情況下，在溶劑諸
 如四氫呋喃、*N,N*-二甲基甲醯胺、乙醇或乙腈中進行。
 20 式 7 的 $\alpha\beta$ -不飽和醯胺可使用與所述用於方案 1 和 2 者

類似的條件，使相應的 $\alpha\beta$ -不飽和酸或酸氯化物與式 3 的胺偶聯而製備。

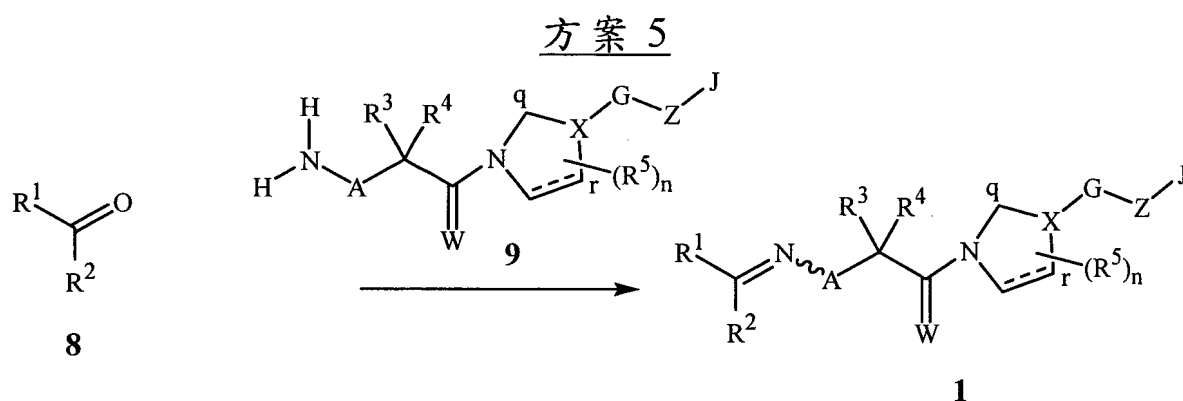
方案 4



式 1 化合物還可如方案 5 所示，通過使式 8 化合物與式 9 化合物反應而製備。該反應是在諸如乙醇、四氫呋喃或水之類的溶劑中，任選在存在諸如乙酸、鹽酸或硫酸之類的酸催化劑的情況下進行。式 9 的酸性鹽也可用於方案 5 的方法中，較佳在存在至少一莫耳當量的酸清除劑（例如吡啶或三乙胺）的情況下使用。酸性鹽可藉由用鹽酸、草酸或三氟乙酸處理式 9 的胺而製備。胺與羰基化合物的反應是為人所熟知的；參見（例如）Dayagi 等人，*The Chemistry of the Carbon-Nitrogen Double Bond*, Patei（編輯），Interscience, New York 1970；Sandler 等人，*Organic Functional Group Preparations*, Academic Press, New York 1972, 3, 372 和 Hilgetag 等人，*Preparative Organic Chemistry*, John Wiley & Sons, New York 1972, 504-515。式 8 化合物是已知的，或者可通過本領域技術人員已知的方法製備。

式 9 化合物可直接製備或通過使相應的式 9 的 *N*-保護化合物去保護而製備。式 9 的 *N*-保護化合物可通過與已針對方案 1、2、3 和 4 所描述的那些類似的方法製備。合適的 *N*-保護的氮基團的選擇對本領域技術人員來說將是顯而易見的；用這些保護基團來保護氮原子的方法描述於對於代表性的例子，請參見 Greene, T. W. 和 Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 第 2 版；Wiley: New York, 1991。

10



15

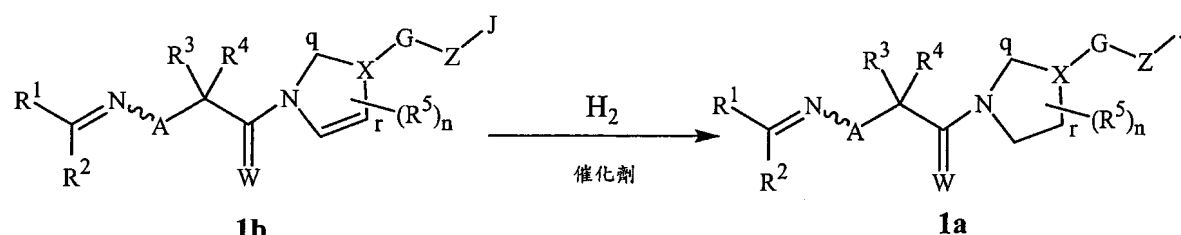
式 1a 化合物（其中含有 X 的環為飽和的式 1 化合物）其中 X 為 X^1 、 X^2 、 X^5 、 X^8 和 X^9 可如方案 6 中所示，通過催化氫化來從相應的式 1b 不飽和化合物製備。使式 1b 化合物與氫氣接觸的典型條件包括：氣壓由約 70 至 700 kPa，較佳 270 至 350 kPa；存在金屬催化劑，例如，諸如活性碳之類的情性載體上負載的鈀（金屬與載體的重量比為 5 至 20%）；懸浮在諸如乙醇之類的溶劑中；在環境溫度（如約 15-20 °C）下。這種類型的還原為人所熟知的；參見（例如）*Catalytic Hydrogenation*, L. Cerveny（編輯），Elsevier Science, Amsterdam, 1986。

20

本領域技術人員將認識到，在催化氫化條件下，可存在於式 **1a** 化合物中的某些其他官能團也可能會被還原，因此需要對催化劑和條件進行適當選擇。

5

方案 6



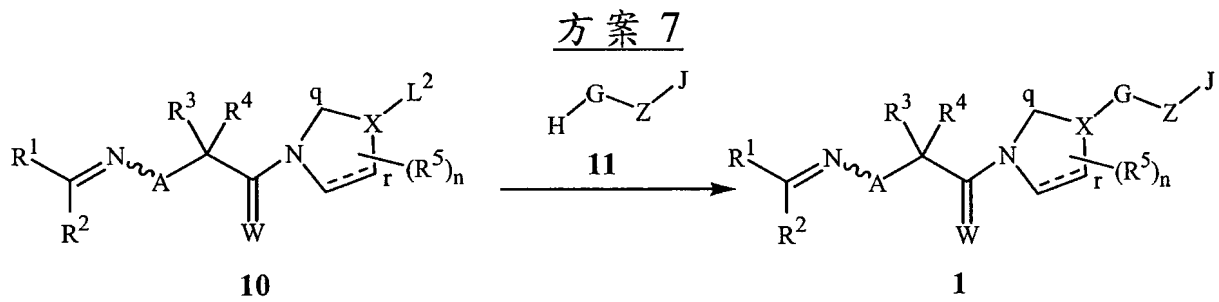
其中 X 為 X¹、X²、X⁵、X⁸ 或 X⁹

10

如方案 7 所述，式 **1** 化合物（其中 X 為 X¹、X⁵、X⁷ 或 X⁹ 並且 G 通過氮原子連接至含有 X 的環）可如方案 7 所示，在存在鹼的情況下，通過用式 **11** 的含氮雜環置換式 **10** 化合物中的合適脫離基 L²（例如 Br、I、或磺酸根如 CH₃S(O)₂O 或 CF₃S(O)₂O）而製備。該反應典型是在約 0 至 80 °C 下，在諸如 N,N-二甲基甲醯胺或乙腈之類的溶劑中並在鹼如氫化鈉或碳酸鉀存在下進行。

15

式 **10** 化合物可用本領域已知的通用方法，從其中 L² 為 OH 的式 **10** 相應化合物製備。

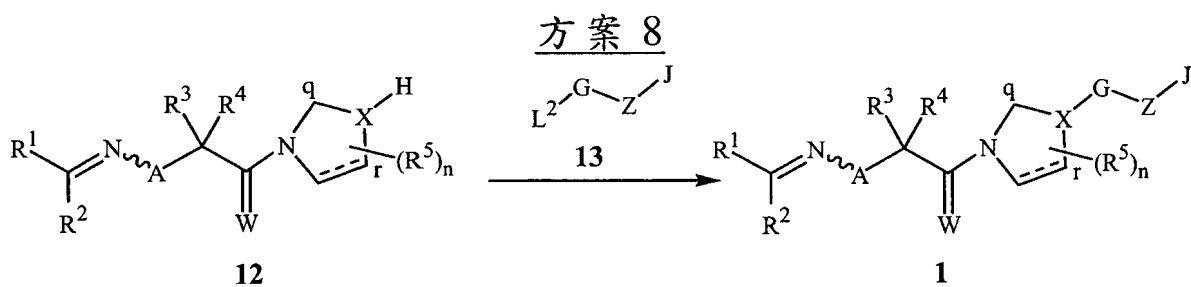


其中L²為脫離基(e. g. Br、I、MeS(O)₂O或CF₃S(O)₂O)

其中X為X¹、X²、X⁵、X⁷或X⁹

式 1 化合物(其中 X 為 X² 或 X⁸)可如方案 8 所示，
 5 通過讓式 12 化合物與式 13 的雜環化合物(其中 L² 為
 脫離基(例如 Br、I、或磺酸根如 CH₃S(O)₂O 或
 CF₃S(O)₂O)反應而製備。該反應是在約 0 至 80 °C 的溫
 度下，在諸如二甲基亞砷、N,N-二甲基甲醯胺或乙腈之
 類的溶劑中，及在存在諸如碳酸鉀之類的鹼的情況下進
 10 行。

式 13 化合物可通過本領域技術人員已知的方法，
 從其中 L² 為 OH 的式 13 對應化合物製備。

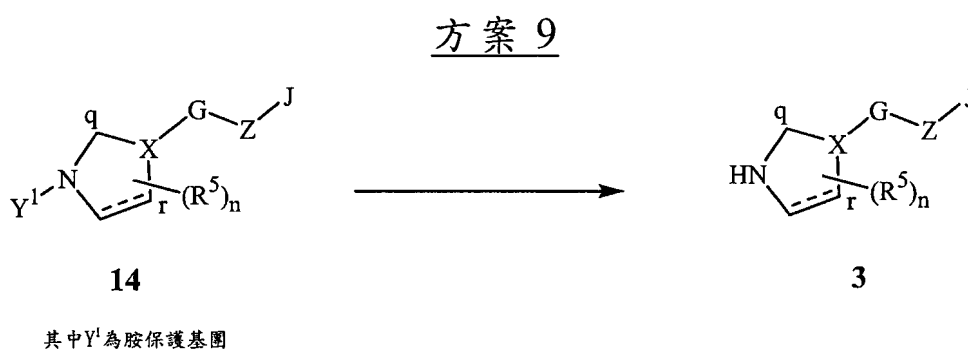


其中L²為脫離基(e. g. Br、I、MeS(O)₂O或CF₃S(O)₂O)

其中X為X²或X⁸

式 3 的胺可如方案 9 所示，通過去保護反應從其中
 Y¹ 為胺保護基團的式 14 化合物製備(用於胺去保護的
 方法參見，例如 Greene, T. W.和 Wuts, P. G. M. *Protective*

Groups in Organic Synthesis, 第 2 版; Wiley: New York, 1991)。眾多各式胺保護基團適用於方案 9 的方法，並期合適保護基團的選擇對化學合成領域中的技術人員來說將是顯而易見的。去保護後，可通過本領域已知的通用方法，將式 3 的胺以酸性鹽或游離胺的形式分離。

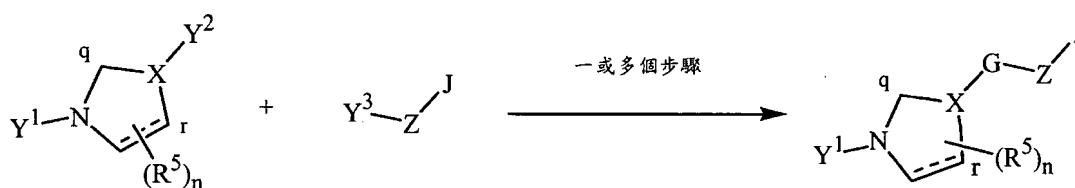


式 14 的胺可通過類似於上文方案 6、7 或 8 中所描述者的那些方法製備，其中式 1b、式 10 和式 12 中的 (R¹)(R²)=N=~AC(R³)(R⁴)C(=W)-部分由 Y¹ 置換。

式 14 的胺也可以如方案 10 所示，通過使經適當官能化的式 15 化合物與經適當官能化的式 16 化合物反應而製備。官能團 Y² 和 Y³ 選自（但不限於）諸如醛、酮、酯、酸、醯胺、硫醯胺、腈、胺、醇、硫醇、肼、肟、脛、脞、醯胺脛、烯、炔、鹵化物、烷基鹵、甲磺酸酯、三氟甲磺酸酯、硼酸、硼酸酯等之類的部分，這些部分在合適的反應條件下，將使得能用以構造多種雜環 G 環。例如，其中 Y² 為硫醯胺基團的式 15 化合物與其中 Y³ 為溴乙醯基團的式 16 化合物反應將得到其中 G 為噻唑環的式 14 化合物。合成文獻描述了許多用於形成 5 員

雜芳環和部分飽和的 5 員雜環（如 G-1 至 G-59）的通用方法；參見（例如）*Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, 第 4-6 卷, A. R. Katritzky 和 C. W. Rees（主編），Pergamon Press, Oxford, 1984; *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, 第 2-4 卷，A. R. Katritzky, C. W. Rees 和 E. F. V. Scriven（主編），Pergamon Press, New York, 1996；和系列叢書 *The Chemistry of Heterocyclic Compounds*, E. C. Taylor（編輯），Wiley, Oxford。式 15 的中間體（其中 X 為 X¹, Y² 為 Br、I、甲磺酸根或三氟甲磺酸根）用於製備用於交叉偶聯反應的有機試劑也已經有所描述；參見（例如）S. Bellotte, *Synlett* 1998, 379-380 和 Nakamura 等人, *Synlett* 2005, 1794-1798。本領域技術人員可以容易地決定 Y² 與 Y³ 所需的合適官能基團來構造所需的雜環 G 環。式 16 和式 17 化合物是已知的且可通過本領域已知的方法製備。

方案 10



15
 其中 Y¹ 為胺保護基團且 Y² 為用以構造所欲 G 環的合適官能基團

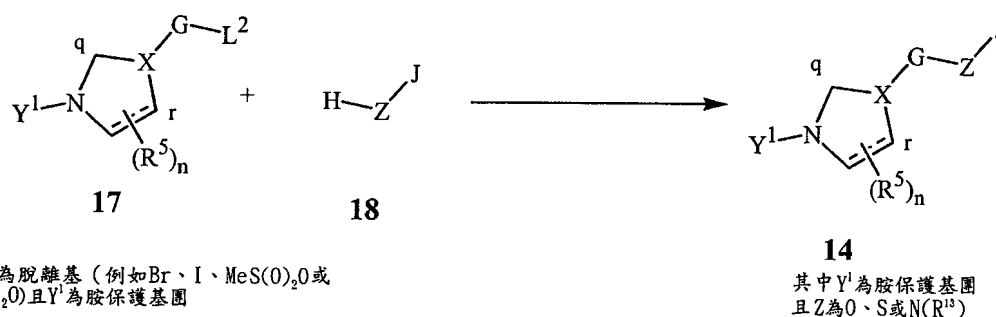
16
 其中 Y³ 為用以構造所欲 G 環的合適官能基團

14 其中 Y¹ 為胺保護基團

其中 Z 為 O、S 或 N(R¹³) 的式 14 化合物可以如方案 11 所示，在存在鹼的情況下，通過用式 18 化合物置換連接至式 17 上的合適脫離基 L²（例如 Br、I 或磺酸

根如 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2\text{O}$ 或 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2\text{O}$) 而製備。合適的鹼包括氫化鈉或碳酸鉀。該反應典型是在約 0 至 80 °C 的溫度下，在諸如 *N,N*-二甲基甲醯胺或乙腈之類的溶劑中進行。式 17 化合物中的合適脫離基包括 (例如) 溴、碘、甲磺酸根 ($\text{OS}(\text{O})_2\text{CH}_3$)、三氟甲磺酸根 ($\text{OS}(\text{O})_2\text{CF}_3$) 等。式 17 化合物可通過本領域已知的通用方法，從其中 L^2 為 OH 的式 17 對應化合物製備。式 18 化合物是已知的並且可通過本領域已知的通用方法製備。

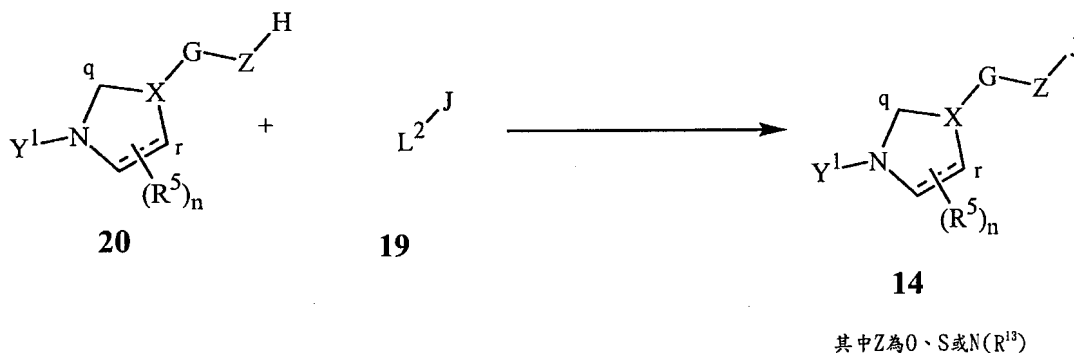
方案 11



其中 Z 為 O 、 S 或 $\text{N}(\text{R}^{13})$ 的式 14 化合物還可以如方案 12 所示，在存在鹼的情況下，通過用式 20 化合物置換連接至式 19 上的合適脫離基 L^2 (例如 Br 、 I 、磺酸根如 $\text{MeS}(\text{O})_2\text{O}$ 或 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2\text{O}$) 而製備。合適的鹼包括氫化鈉或碳酸鉀。該反應典型是在約 0 至 80 °C 的溫度下，在諸如 *N,N*-二甲基甲醯胺或乙腈之類的溶劑中進行。

式 19 化合物可通過本領域已知的通用方法，從其中 L^2 為 OH 的式 19 對應化合物製備。許多式 19 化合物是已知的並且可通過本領域已知的通用方法製備。

方案 12

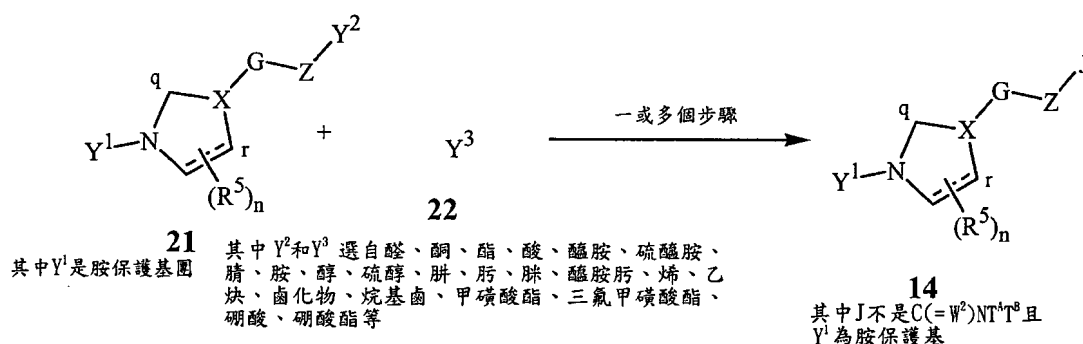


其中 L² 為脫離基 (e. g. Br、I、MeS(O)₂O 或 CF₃S(O)₂O) 且 Y¹ 為胺保護基團

5 如方案 13 所示，其中 J 不是 C(=W²)NT^AT^B 的式 14
 化合物也可通過使式 21 化合物與式 22 化合物反應而製
 備，官能團 Y² 和 Y³ 選自 (但不限於) 諸如醛、酮、酯、
 酸、醯胺、硫醯胺、腈、胺、醇、硫醇、胼、肟、脛、
 醯胺肟、烯、乙炔、鹵化物、烷基鹵、甲磺酸酯、三氟
 10 甲磺酸酯、硼酸、硼酸酯等之類的部分，這些部分在合
 適的反應條件下，將使得能構造多種雜環 J 環。例如，
 其中 Y² 為氯肟部分的式 21 化合物與其中 Y³ 為烯類或
 乙炔的式 22 化合物在存在鹼的情況下反應，將得到其
 中 J 分別為異噁唑啉或異噁唑的式 14 化合物。合成文
 15 獻包括多種用於形成碳環和雜環以及環系統 (例如 J-1
 至 J-82) 的通用方法；參見 (例如) *Comprehensive
 Heterocyclic Chemistry*, 第 4-6 卷，A. R. Katritzky 和 C.
 W. Rees (編輯)，Pergamon Press, New York, 1984；
Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, 第 2-4 卷，A.
 20 R. Katritzky, C. W. Rees 和 E. F. Scriven (編輯)，
 Pergamon Press, New York, 1996；系列叢書 *The*

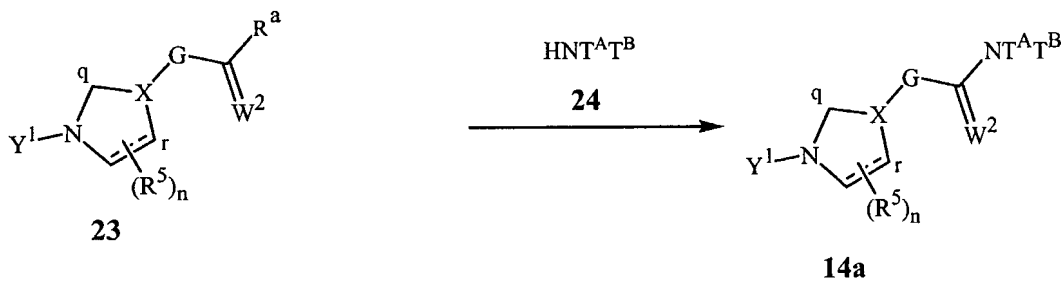
Chemistry of Heterocyclic Compounds, E. C. Taylor (編輯), Wiley, New York 和 *Rodd's Chemistry of Carbon Compounds*, 第 2-4 卷, Elsevier, New York。腓氧化物與烯烴環加成的一般方法在化學文獻中已經得到很好論證。相關參考文獻請參見 Lee, *Synthesis* **1982**, 6, 508-509 和 Kanemasa 等人, *Tetrahedron* **2000**, 56, 1057-1064 以及其中引用的參考文獻。本領域技術人員可以容易地決定合適的式 21 與式 22 化合物來構造尤為所欲的雜環 J 環。式 22 化合物是已知的並且可通過本領域已知的一般方法製備。

方案 13



如方案 14 所示，其中 W² 為 O 的式 14a (其中 Z 為直接鍵，且 J 為 C(=W²)NT^AT^B 的式 14) 化合物可通過使用類似所述用於方案 1 和 2 者的條件的醯胺鍵形成反應來製備。

方案 14



其中 Y¹ 為胺保護基團，R^a 為 C¹ 或 OH 且 W² 為 O

其中 Z 為直接鍵、J 為 C(=W²)NT^AT^B 且 W² 為 O

5 製備式 **14a** 化合物的備選方法揭露於 PCT 專利公
開案第 WO 2007/014290 號。

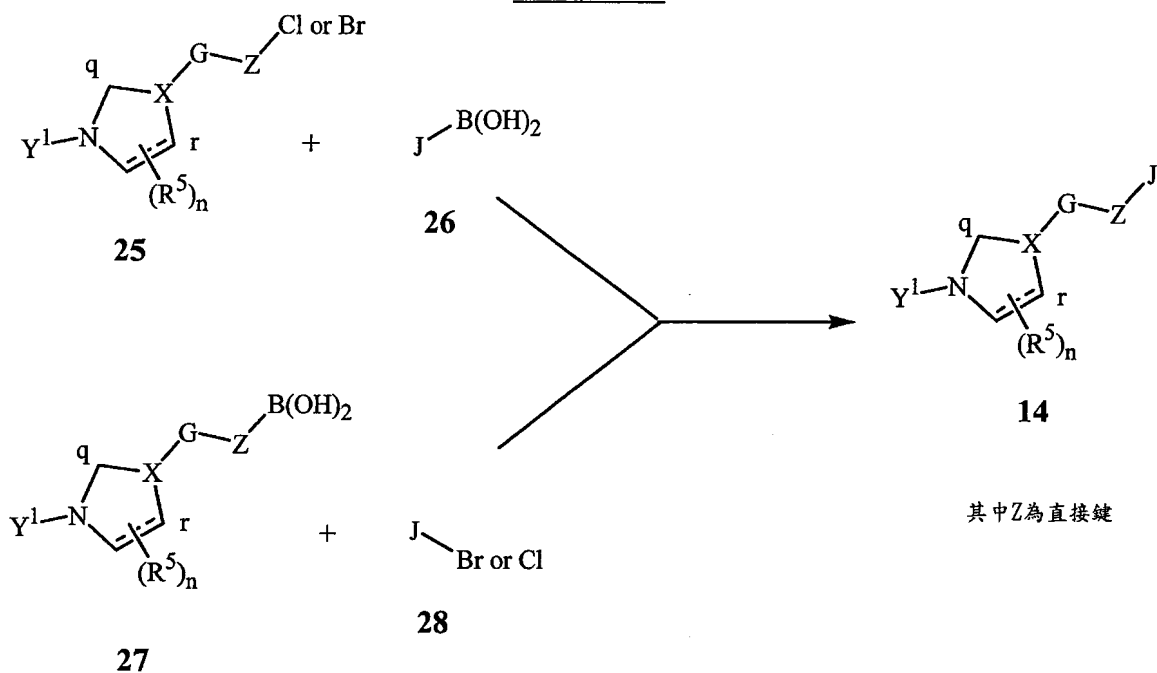
10 在後續步驟中，使用多種標準的硫雜化試劑例如五
硫化物或 2,4-雙(4-甲氧苯基)-1,3-二硫雜-2,4-二磷雜環
丁烷-2,4-二硫化物（拉韋松試劑），將其中 W² 為 O 的
式 **14a** 的醯胺轉換為其中 W² 為 S 的式 **14a** 的相應硫醯
胺。

15 在如方案 15 所示的備選製備方法中，其中 Z 為直
接鍵的式 **14** 化合物可利用熟知的 Suzuki 鈀催化交叉偶
聯反應條件，使式 **25** 或 **28** 的鹵化物（Br 或 Cl）與式
20 **26** 或 **27** 的硼酸偶聯而製備。許多催化劑可用於 Suzuki
反應；尤為有用的催化劑是四(三苯膦)鈀(0)與[1,1'-雙-
(二苯基膦基)二茂鐵]二氯鈀(II)。諸如四氫呋喃、乙
腈、二乙醚和二噁烷之類的溶劑是合適的。Suzuki 反應
及相關的偶聯方法為形成 G-J 鍵提供了許多備選方案。
對於主要的參考文獻；請參見（例如）Zifacsak 等人，
Tetrahedron **2004**, *60*, 8991–9016。對於適用於合成 G-J
鍵的鈀催化交叉偶聯反應的全面綜述，請參見

Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist, J. J. Li 和 G. W. Gribble (編輯), Elsevier, Oxford, UK, 2000。

5

方案 15



其中 Y¹ 為胺保護基團
且 Z 為直接鍵

10

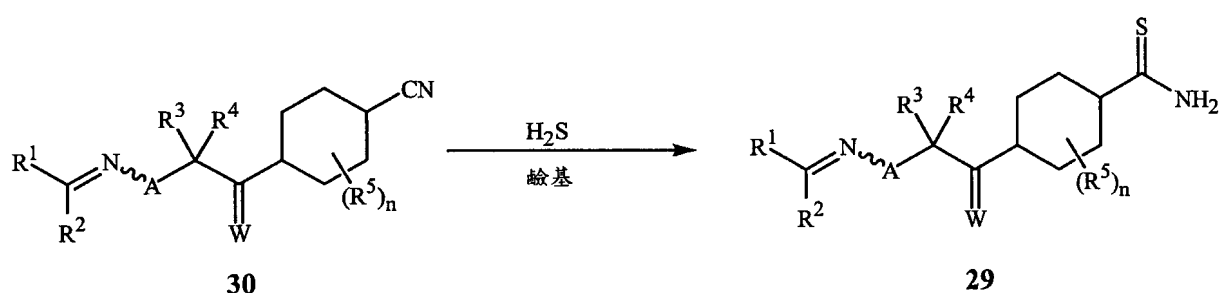
本領域技術人員將認識到，許多式 1 化合物可通過使用與上述方案 10 至 15 中所述的那些類似的方法直接製備，其中基團 Y¹ 被 (R¹)(R²)=N~AC(R³)(R⁴)C(=W)- 部分代替。因 Below 28: 其中 Y¹ 為胺保護基團且 Z 為直接鍵，與其中 Y¹ 被 (R¹)(R²)=N~AC(R³)(R⁴)C(=W)- 代替的式 15、17、20、21、23、25 和 27 對應的化合物是製備式 1 化合物的有用中間體。

15

製備其中 X 為 X¹ 的式 1 化合物的特別有用的中間體為式 29 的硫醯胺，其可如方案 16 所示，通過用硫化

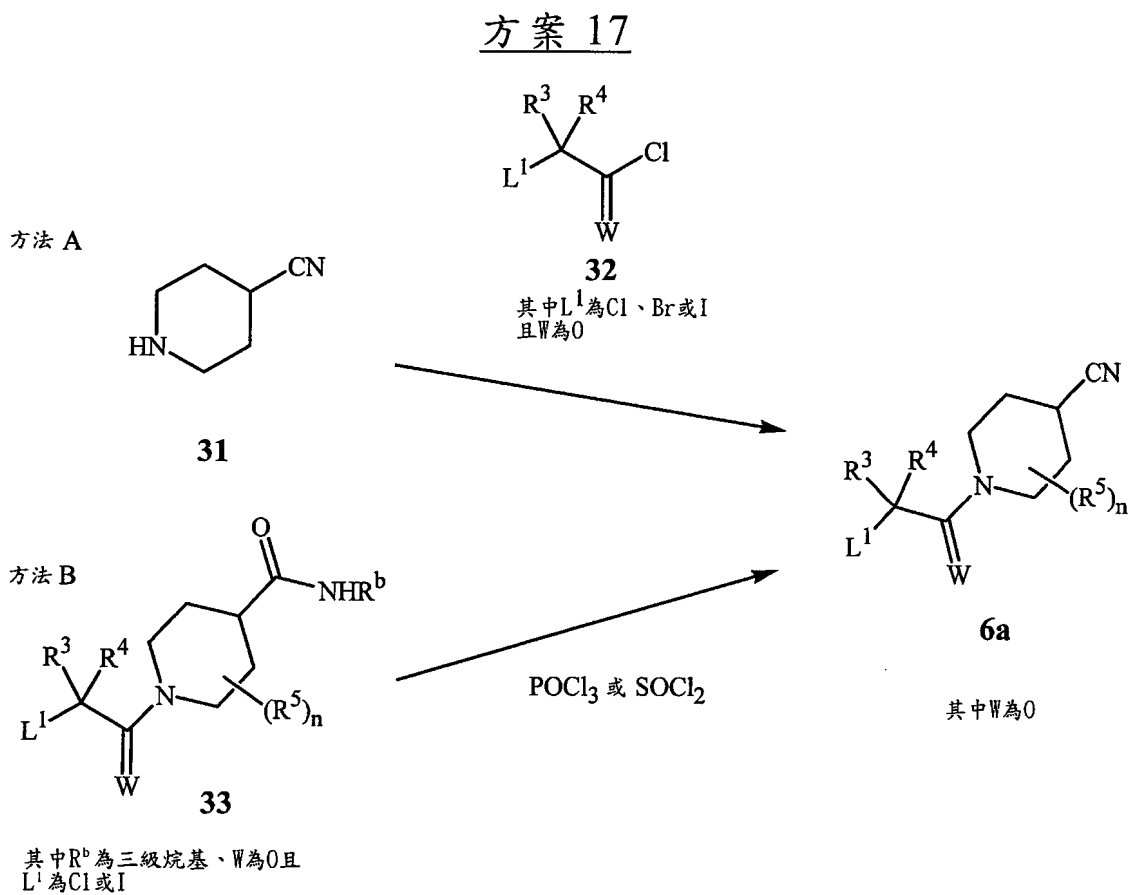
氫處理而製備自相應式 30 的脛。方案 16 的反應可通過在存在諸如吡啶、二乙胺或二乙醇胺之類的胺的情況下，使式 30 化合物與硫化氫接觸而進行。作為另外一種選擇，可將硫化氫以其二硫鹽的形式並組合鹼金屬或
5 鹼使用。這種類型的反應在文獻中得到很好論證；參見（例如）歐洲專利第 EP 696581 號。

方案 16



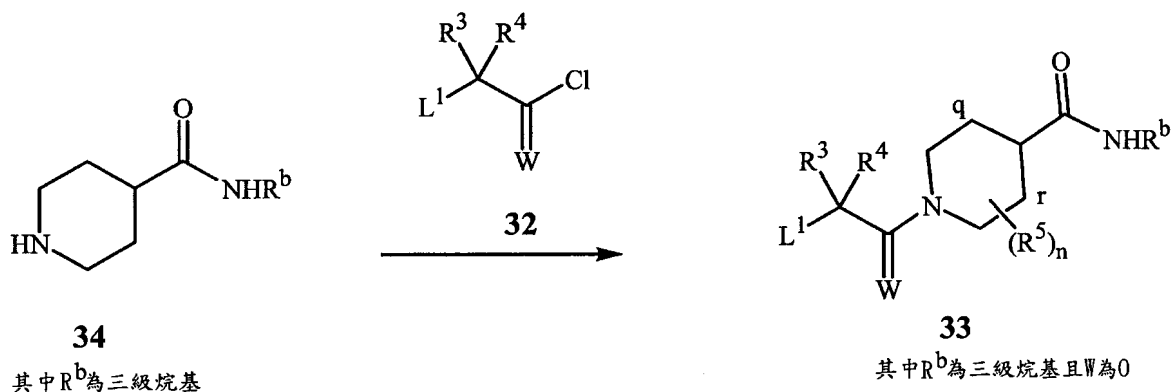
式 30 化合物可通過使用類似所述於方案 1、2、3、4 或 5 者的方法製備，其中 X 為 X¹，並且式 3、6、7 和 9 化合物中的 G-Z-J 被氰基代替。尤為有用的是類似方案 3 的方法其中式 6 係用式 6a（其中 X 為 X¹ 且 G-Z-J 用氰基代替）的化合物代替。式 6a 化合物通常是在存在鹼的情況下，將式 31 的氰基哌啶與合適的式 32 的醯基氯接觸而製備。較佳的條件涉及使用諸如鹼金屬或鹼土金屬碳酸鹽、碳酸氫鹽或磷酸鹽之類的無機鹼的水溶液和諸如甲苯、乙酸乙酯或 1,2-二氯乙烷之類的非水混
10 溶性有機溶劑。式 6a 化合物亦可通過使 R^b 為三級烷基例如 C(Me)₃ 的式 33 化合物在合適的溶劑中接觸醯胺去水試劑例如亞硫醯氯或磷醯氯而製備，如方案 17 的方
15
20

法 B 所示。對這種轉化來說特別較佳的溶劑是 *N,N*-二烷基醯胺例如 *N,N*-二甲基甲醯胺。該反應通常是通過在加料期間反應可快速進行的溫度（溫度通常為約 35 至 55 °C 間），將 0.9 至 2 當量（較佳 1.1 當量）的磷氧氯化物或亞硫醯氯加至式 33 化合物與 0.5 至 10 重量份溶劑的混合物而進行。



如方案 18 所示，式 33 化合物可通過與方案 17 中的方法 A 類似的方法來製備。

方案 18

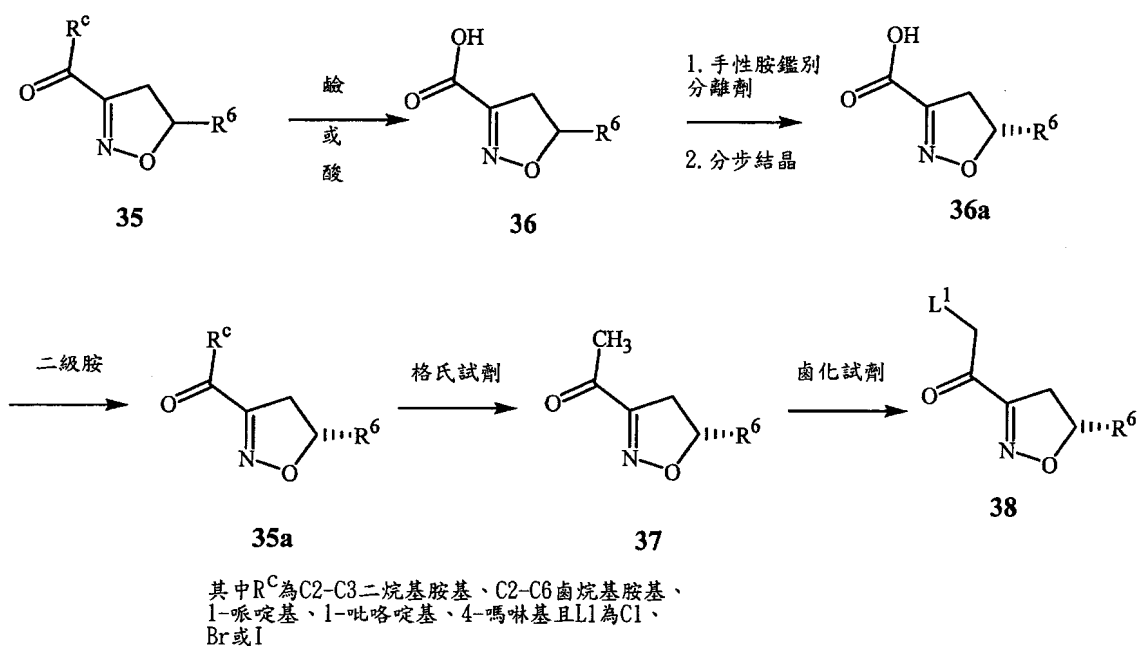


5 從 4-氰基吡啶或異煙酸製備式 34 化合物的方法是本領域已知的；參見例如德國專利第 DE 3537762 號關於從氰基吡啶和三級丁醇製備 *N*-三級丁基吡啶甲醯胺的內容以及 Nelsen 等人，*J. Org. Chem.*, 1990, 55, 3825 關於用鉑催化劑氫化 *N*-甲基異煙醯胺的內容。

10 式 38 的鹵酮是用於製備其中 J 是（例如）選自如示例 A 中所示的 J-29-1 至 J-29-12 的式 1 的某些手性化合物的特別有用的中間體。值得注意的式 38 (*R*) 構型鹵酮中間體在與式 39 的硫醯胺偶聯後（在偶聯後可能需要進一步的步驟以得到式 1 化合物），提供較高殺真菌活性的式 1 最終產物。式 38 的鹵酮可如方案 19 所示，

15 通過多步反應序列製備。

方案 19



在方案 19 中，將式 35 化合物根據熟知的方法在鹼性或酸性條件下進行水解，以提供式 6 化合物。例如，

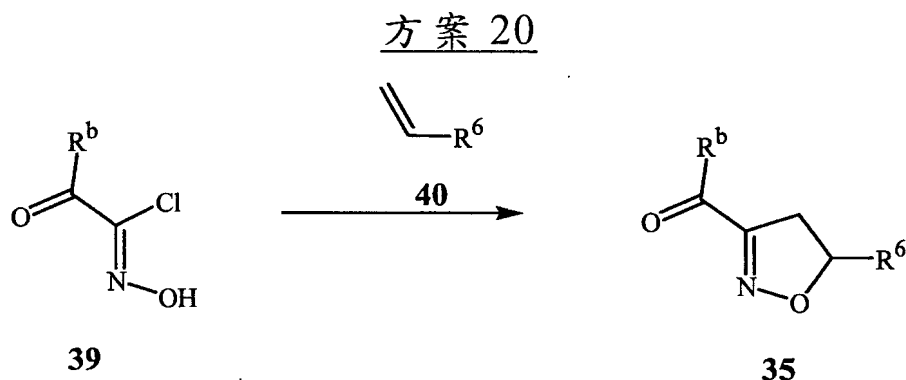
5 在約 25 至 45 °C 的溫度下，用氫氧化鈉（較佳為相對於式 35 化合物莫耳數稍微過量的氫氧化鈉）在合適溶劑（例如甲醇或四氫呋喃）中處理式 35 化合物，而提供式 36 化合物的鹽類。可通過將反應混合物的 pH 調節至約 1 至 3，然後過濾反應混合物或用有機溶劑（任選在反應混合物濃縮後進行）萃取反應混合物來分離式 36 的羧酸產物。式 36 的外消旋化合物可通過與合適的手性胺鑑別分離劑反應以形成非鏡像異構物鹽，而後用經典分步結晶法來拆分以提供式 36a 化合物（純鏡像異構物或鏡像異構物富集的）。合適的手性胺鑑別分離劑例如金雞納寧、二氫金雞納寧或它們的混合物。比率為約

10 85:15 的金雞納寧-二氫金雞納寧混合物是特別有用的，因為其可提供例如作為溶解度較小的鹽的(R)-構型

15

的式 36a 羧酸（其中 R⁶ 是經取代的苯基）。此外，這些手性胺鹼在商業來源上是易得的。使用類似於方案 1 或 2 所述者的醯胺鍵將 36a 化合物轉換為式 35a 的手性醯胺。式 37 的酮可這樣製備：首先使對應的式 35a 的醯胺（純鏡像異構物形式或鏡像異構物富集的混合物）與一莫耳當量的格氏試劑如甲基鎂鹵化物在合適的溶劑或溶劑混合物（例如四氫呋喃和甲苯）中於約 0 至 20 °C 的溫度下反應。式 37 的酮可通過用水性酸驟冷反應混合物、用有機溶劑萃取以及濃縮來分離。式 37 的酮可直接使用而無須進一步純化或用所屬領域已知的標準方法來純化。用諸如磺醯氯或溴之類的試劑鹵化的式 37 的化合物以得到式 38 的鹵酮。式 38 的鹵酮可通過從諸如己烷或甲醇之類的溶劑結晶而純化，或可無需進一步純化而用於與硫醯胺的縮合反應。

式 35 的異噁唑甲醯胺可如方案 20 所示，通過對應的式 39 的異脛肟醯氯與式 40 的烯烴衍生物環加成而製備。



其中 R^b 為 C2-C3 二烷基胺基、C2-C6 鹵烷基胺基、1-吡啶基、1-吡咯啶基、4-嗎啉基

在方案 20 的方法中，使式 39 化合物和式 40 化合物在存在鹼的情況下接觸，接觸方式使得式 39 的異羥肱醯氯的水解或二聚化程度最小。在一種典型的方法中，將鹼（其可以是三級胺鹼例如三乙胺或無機鹼例如鹼土金屬碳酸鹽、碳酸氫鹽或磷酸鹽）與式 40 化合物混合，並逐漸加入式 39 化合物，在環加成可以相對較快的速率下進行的溫度下實現，通常在 5 和 25 °C 之間。或者，可將鹼逐步加至另兩種組分（式 39 化合物和式 40 化合物）中。當式 39 異羥肱醯氯在反應介質中基本上不溶解時，這種可供選擇的方法是較佳的。反應介質中的溶劑可以是水或惰性溶劑例如甲苯、己烷或甚至是過量使用的烯烴。可通過過濾或用水洗滌，然後蒸發溶劑來從鹽共產物分離產品。可通過結晶純化粗產物，或該粗產物可直接用於方案 19 的方法中。式 35 化合物是對應的式 37 甲基酮和式 38 鹵甲基酮的有用前體，並且還可如方案 19 所示，通過水解、拆分、甲基酮合成和鹵化，用於製備拆分的式 37 和 38 的鏡像異構物。

已經認識到，上面關於製備式 1 化合物所述的某些試劑和反應條件可能會與中間體中存在的某些官能團不相容。在這些情況中，在合成中整合進保護/去保護步驟或官能團互換將有助於獲得所需產物。保護基團的使用和選擇對化學合成領域的技術人員來說將是顯而易見的（參見例如 T. W. Greene 和 P. G. M. Wuts, *Protective Groups in Organic Synthesis*, 第 2 版；Wiley: New York, 1991）。本領域技術人員將認識到，在某些情況下，將給定試劑如其在任何單獨方案中所示引入後，

可能有必要執行未詳細描述的額外常規合成步驟來完成式 1 化合物的合成。本領域技術人員還將認識到，可能有必要以不同於製備式 1 化合物所提出的具體順序所包含的步驟執行上述方案中所示步驟的組合。

5 本領域技術人員還將認識到，本文描述的式 1 化合物和中間體可發生多種親電反應、親核反應、自由基反應、有機金屬反應、氧化反應和還原反應，以添加取代基或使現有取代基改性。

10 無需進一步的詳盡細節，據信利用先前的描述，本領域技術人員可就其最大程度對本發明進行利用。因而，下面的「實例」應被理解為僅僅是示例性的，並且不以任何方式限制本公開。下面「實例」中的步驟示出了整個合成轉化中每步的工序，並且每步的原料可能不一定已通過其工序在其他「實例」或「步驟」中描述了
15 的具體製備操作製備。除色譜溶劑混合物或另外指明的地方外，百分比是以重量計。除非另外指明，否則關於色譜溶劑混合物的份數和百分比是以體積計。¹H NMR 譜是以相對於四甲基矽烷向低場偏移的 ppm 計；「s」指單峰，「d」指雙重峰，「t」指三重峰，「q」指四重峰，
20 「m」指多重峰，「dd」指雙重峰的雙重峰，「dt」指三重峰的雙重峰，「br s」指寬單峰，而「br m」指寬多峰。

實例 1

25 2,2,2-三氟乙醛 *O*-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噁唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]肟（化合物 3）的製備

步驟 A： 5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-*N,N*-二甲基-3-異噁唑甲醯胺的製備

將 2-(二甲基胺基)-*N*-羥基-2-側氧乙亞胺醯氯(94.0 g, 0.62 mol)和氯苯(275 g)中的 2,6-二氟苯乙烯(84.0 g, 0.60 mol)溶液倒入配備有機械攪拌器、溫度計和加料漏斗的 1000-mL 圓底燒瓶中。讓反應混合物冷卻至 10 °C，然後在 1 小時期間逐滴加入水(350 mL)中的碳酸氫鉀(70 g, 0.70 mol)溶液，同時將反應溫度保持在 10 至 15 °C 之間。當對反應混合物進行的氣相色譜分析表明剩下約 3%的 2-(二甲基胺基)-*N*-羥基-2-側氧-乙亞胺醯氯時，向該混合物加入水(200 mL)，並分離層。用水(300 mL)洗滌有機相並在減壓下濃縮。向所得殘餘物中加入甲苯，並在減壓下再度濃縮該混合物，從而得到油狀標題化合物(144 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 3.1 (s, 3H), 3.3 (s, 3H), 3.4 (m, 1H), 3.57 (m, 1H), 6.0 (m, 1H), 6.95 (m, 2H), 7.35 (m, 1H)。

步驟 B： 1-(4,5-二氫-5-(2,6-二氟苯基)-3-異噁唑基)乙酮的製備

向配備有溫度計和加料漏斗的 1000-mL 燒瓶倒入 5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-*N,N*-二甲基-3-異噁唑甲醯胺(即步驟 A 的產物)(80.0 g, 0.31 mol)和甲苯(320 mL)。將反應混合物冷卻至 -5 °C，並逐滴加入甲基溴化鎂溶液(四氫呋喃中為 3.0 M, 120 mL, 0.36 mmol)，同時將反應溫度保持在 -10 至 -5 °C 之間。當對反應混合物進行

的氣相色譜分析表明剩下約 2% 的 5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-*N,N*-二甲基-3-異噁唑甲醯胺時，將反應混合物傾注入濃鹽酸(80 mL)和水(320 mL)的攪拌溶液中，同時保持混合物溫度在 10 至 30 °C 之間。分離有機層並將其用飽和氯化鈉水溶液(80 mL)洗滌，在減壓下濃縮。將所得油狀物從己烷(100 mL)結晶，通過過濾收集，用己烷洗滌。所得固體在 23°C 下在真空烘箱中乾燥過夜，從而得到標題化合物的蠟質灰白色固體(65 g)，熔點為 47-50 °C。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): δ 2.6 (s, 3H), 3.3 (m, 1H), 3.5 (m, 1H), 6.1 (m, 1H), 6.9 (m, 2H), 7.3 (m, 1H)。

步驟 C： 2-溴-1-(4,5-二氫-5-(2,6-二氟苯基)-3-異噁唑基)乙酮的製備

向配備有機械攪拌器、溫度計、加料漏斗和清洗器的 500-mL 燒瓶倒入 1-(4,5-二氫-5-(2,6-二氟苯基)-3-異噁唑基)乙酮(即步驟 B 的產物)(60.0 g, 0.27 mmol)和二氯甲烷(130 mL)。將反應混合物在 33°C 下加熱，並通過加料漏斗逐滴加入二氯甲烷(100 mL)中的溴溶液(39.2 mL, 0.24 mol)。已經加入約 5 mL 溴溶液後，停止加入並在 33°C 下攪拌反應混合物約 10 分鐘，期間反應混合物的顏色由紅色變成黃色。將反應混合物冷卻至 5°C，並在 90 分鐘期間逐滴加入剩餘的溴溶液。加料完成後，用水性亞硫酸氫鈉溶液(100 mL 水中為 3.5 g)洗滌反應混合物，溶液分層後減壓濃縮有機層。將己烷

加入所得殘餘物，並且將混合物過濾並用己烷潤洗從而得到標題化合物的棕色固體(73 g)，其無需進一步純化便可使用。

5 步驟 D： 4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]哌啶的製備

將 1-三級丁氧基羰基哌啶-4-硫甲醯胺(7.33 g, 30 mmol)和 2-溴-1-(4,5-二氫-5-(2,6-二氟苯基)-3-異噁唑基)乙酮(即步驟 C 的產物)(9.12 g, 30 mmol)在丙酮(100 mL)中的混合物在 45°C 下加熱 3 小時，然後在室溫下攪拌過夜。將反應混合物濃縮，將所得殘餘物溶解於二氯甲烷(100 mL)和三氟乙酸(40 mL)中，在室溫下攪拌 3 小時，然後減壓濃縮。將所得油狀物溶解於鹽酸水溶液(0.5 N, 200 mL)中並用乙酸乙酯萃取。通過加入氫氧化鈉水溶液(在水中為 10%)使有機層鹼化。分離有機層，然後將其用飽和氯化鈉水溶液洗滌、用硫酸鎂乾燥、過濾並減壓濃縮，從而得到標題化合物的黏稠琥珀酸油狀物(8.62 g，重量包括殘留的乙酸乙酯)。

將更多氫氧化鈉水溶液(在水中為 50%)加入鹽酸溶液通過加入來鹼化，然後用乙酸乙酯萃取混合物。將有機層用飽和氯化鈉水溶液洗滌、用硫酸鎂乾燥，過濾並減壓濃縮，從而得到標題化合物的油狀物(1.33 g，重量包括殘留的乙酸乙酯)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 1.70-1.80 (m, 2H), 1.87 (br s, 1H), 2.22 (m, 2H), 2.77 (m, 2H), 3.18 (m, 3H), 3.62 (m, 1H),

3.80 (m, 1H), 6.05 (m, 1H), 6.92 (m, 2H), 7.30 (m, 1H),
7.64 (s, 1H)。

步驟 E： 2,2,2-三氟乙醛 O-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯
5 基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-吡啶
基]-2-側氧乙基]肼的製備

讓 O-(羧甲基)脛胺半鹽酸鹽(5.5 g, 25 mmol)和
2,2,2-三氟-1,1-乙二醇 (10 g, 75 mmol, 水中的 75%溶
液) 的混合物靜置。4 天後，將該反應混合物用二氯甲
10 烷稀釋、用水洗滌、用硫酸鎂乾燥、過濾並減壓濃縮，
從而得到 2-[(2,2,2-三氟亞乙基)胺基]氧基]乙酸的白色
粉末(6.5 g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): δ 4.80 (s, 2H), 7.58 (m, 1H), 10.4 (br s,
1H)。

15 將 2-[(2,2,2-三氟亞乙基)胺基]氧基]乙酸 (如上段
所述方式準備) (565 mg, 3.3 mmol)、4-[4-[5-(2,6-二氟
苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]吡啶 (即步驟 D
的產物) (1.50 g, 3.0 mmol)、*N*3-(乙基碳二亞胺)-*N*1,*N*1-
二甲基-1,3-丙二胺鹽酸鹽(633 mg, 3.3 mmol)、1-脛基苯
20 并三唑(40.5 mg, 0.30 mmol)和三乙胺(460 μL , 3.3 mmol)
在二氯甲烷(8 mL)中的混合物在室溫下攪拌。3 小時
後，用二氯甲烷稀釋反應混合物，並用水、鹽酸(1 N)、
水、飽和碳酸氫鈉水溶液和飽和氯化鈉水溶液洗滌。將
有機層用硫酸鎂進行乾燥、過濾並減壓濃縮，從而得到
25 黃色油狀物(1.3 g)。將該油狀物從乙酸甲酯(5 mL)結

晶，從而得到標題化合物（本發明化合物）的白色固體 (0.55 g)，熔點為 123-126 °C。

將戊烷(10 mL)加至該乙酸甲酯濾液中並過濾該混合物。將所得固體從甲醇(3 mL)中結晶，以得到更多的
5 標題化合物白色固體(455 mg)，熔點為 124-127 °C。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): δ 1.75-1.90 (m, 2H), 2.15-2.27 (m, 2H),
2.88 (m, 1H), 3.22 (m, 1H), 3.32 (m, 1H), 3.63 (m, 1H),
3.75-3.85 (m, 2H), 4.62 (m, 1H), 4.90 (m, 2H), 6.07 (m,
1H), 6.92 (m, 2H), 7.30 (m, 1H), 7.60 (m, 1H), 7.66 (s,
10 1H)。

實例 2

環戊酮 *O*-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噁唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]肟（化合物 5）的製備

15 步驟 A： 2-氯-1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噁唑基]-1-哌啶基]乙酮的製備

在 0°C 下，向 4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噁唑基]哌啶(即實例 1 步驟 D 的產物)(4.2 g, 12.0 mmol)和 *N,N*-二異丙基乙胺(1.63 g, 12.6 mmol)在二氯甲烷(25 mL)中的混合物加入 2-氯乙醯氯(1.43 g, 1.26 mmol)在二氯甲烷(3 mL)中的溶液，而後讓該反應混合物升溫至室溫。4 小時後，將反應混合物傾注到水中並且分層。將有機層用水性鹽酸溶液(1 N)、飽和碳酸氫鈉水溶液和飽和氯化鈉水溶液洗滌、用硫酸鎂乾燥、
20 過濾並減壓濃縮。通過在矽膠上進行的中壓液相色譜
25

(己烷中 0 至 100%梯度的乙酸乙酯作為洗脫液) 對所得殘餘物進行純化，從而得到標題化合物的棕褐色固體 (2.8 g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): δ 1.78-1.97 (m, 2H), 2.18-2.31 (m, 2H),
2.86-2.95 (t, 1H), 3.26-3.39 (m, 2H), 3.60-3.86 (m, 2H),
3.95-4.02 (d, 1H), 4.04-4.16 (m, 2H), 4.57-4.62 (d, 1H),
6.07-6.12 (m, 1H), 6.09-6.12 (m, 2H), 7.26-7.36 (m, 1H),
7.66 (s, 1H)。

10 步驟 B： 環戊酮 *O*-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]肟的製備

在 0°C 下向氫化鈉 (0.024 g, 0.60 mmol, 在礦物油中為 60%) 在四氫呋喃 (3 mL) 中的混合物加入環戊酮肟 (49.57 mg, 0.50 mmol) 在四氫呋喃 (2 mL) 中的溶液。在
15 0°C 下攪拌該反應混合物 30 分鐘，然後加入 2-氯-1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]乙酮 (即步驟 A 的產物) (0.19 g, 0.45 mmol) 在四氫呋喃 (2 mL) 中的溶液。讓該反應混合物升
20 溫至室溫。2 小時後，將水 (5 mL) 緩慢加入該反應混合物中並用乙酸乙酯萃取該所得混合物。將有機層用硫酸鎂乾燥、過濾並減壓濃縮。通過在矽膠上進行的中壓液相色譜 (己烷中 0 至 100%梯度的乙酸乙酯作為洗脫液) 對所得殘餘物進行純化，從而得到標題化合物 (本發明
25 化合物) 的琥珀色油狀物 (0.162 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 1.60-1.70 (m, 2H), 1.70-1.84 (m, 4H),
2.12-2.24 (m, 2H), 2.32-2.41 (m, 2H), 2.42-2.52 (m, 2H),
2.79-2.89 (m, 1H), 3.18-3.26 (m, 1H), 3.26-3.37 (m, 1H),
3.60-3.67 (m, 1H), 3.73-3.83 (m, 1H), 3.98-4.03 (m, 1H),
4.60-4.64 (m, 1H), 4.71 (s, 2H), 6.03-6.13 (m, 1H),
6.88-6.96 (m, 2H), 7.25-7.36 (m, 1H), 7.63 (s, 1H)。

實例 3

N-甲基-*N*-[(1*R*)-1-苯乙基]-2-[1-[2-[(2,2,2-三氟亞乙基)胺基]氧基]乙醯基]-4-哌啶基]-4-噻唑甲醯胺(化合物 31)的
製備

向 1,1-二甲基乙基 4-[4-[[甲基[(1*R*)-1-苯乙基]胺基]羰基]-2-噻唑基]-1-哌啶羧酸酯(2.0 g, 4.65 mmol) (對於製備方法, 參見 PCT 專利公開申請案第 WO 2007/014290 號) 在二乙醚中的混合物加入鹽酸 (在二乙醚中為 2 N, 23 mL)。將該反應混合物在室溫下攪拌 3 小時, 然後通過過濾收集固體物質, 從而得到 *N*-甲基-*N*-[(1*R*)-1-苯乙基]-2-(4-哌啶基)-4-噻唑甲醯胺鹽酸鹽 (1.2 g)。將 *N*-甲基-*N*-[(1*R*)-1-苯乙基]-2-(4-哌啶基)-4-噻唑甲醯胺鹽酸鹽(0.11 g, 0.30 mmol)、(2-[(2,2,2-三氟亞乙基)胺基]氧基]乙酸(通過實例 1 步驟 E 中所述的方法製備) (62 mg, 0.36 mmol)、*N*-(3-二甲基胺丙基)-*N*-乙基碳二亞胺鹽酸鹽(81 mg, 0.42 mmol)、*N*-羥基苯并三唑(5 mg)和三乙胺(0.10 mL, 0.72 mmol)在乾二氯甲烷(8 mL)中的混合物在室溫下攪拌 3 小時。將反應混合物用

二氯甲烷稀釋，然後用水、鹽酸(0.1 N)、水、飽和碳酸氫鈉水溶液和飽和氯化鈉水溶液洗滌，並用硫酸鎂乾燥、過濾和減壓濃縮，從而得到標題化合物（本發明化合物）的黏稠油狀物(130 mg)。

5 ^1H NMR (CDCl_3) δ 1.60-1.90 (br m, 5 H), 2.10-2.25 (br m, 2 H), 2.7-3.0 (br m, 4H), 3.15-3.30 (br m, 2 H), 3.7-3.85 (br m, 1 H), 4.4-4.6 (br m, 1H), 4.88 (br s, 2 H), 5.7-6.2 (br m, 1H), 7.25-7.40 (m, 5H), 7.60 (m, 1H), 7.84 (s, 1H)。

10

實例 4

2,2,2-三氟乙醛 2-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]-2-甲基脞（化合物 35）
的製備

15 步驟 A： 1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-(1-甲基胼基)乙酮
的製備

20 在 0°C 下向甲基胼(532 μL , 10.0 mmol)在四氫呋喃(1 mL)中的混合物逐滴加入 2-氯-1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]乙酮(即實例 2 步驟 A 的產物)(425 mg, 1.0 mmol)在四氫呋喃(5 mL)中的溶液。在室溫下將該反應混合物攪拌過夜，然後減壓濃縮。將所得殘餘物溶解於二氯甲烷中，用水和飽和氯化鈉水溶液洗滌、用硫酸鎂乾燥、過濾並減壓濃

縮，從而得到標題化合物油狀物（包括殘餘四氫呋喃，重 0.59 g），其可使用而無需進一步純化。

步驟 B： 2,2,2-三氟乙醛 2-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-
5 二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側
氧乙基]-2-甲基脞的製備

向 1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁
基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-(1-甲基胍基)乙酮(即步驟 A
的產物)(包括殘餘四氫呋喃，重 0.29 g)在甲醇(3 mL)
10 中的混合物加入 2,2,2-三氟-1,1-乙二醇(209 mg, 1.35
mmol，在水中為 75%)。將該反應混合物在室溫下攪拌
過夜，然後用二氯甲烷稀釋。將有機層用水和飽和氯化
鈉水溶液洗滌、用硫酸鎂乾燥、過濾並減壓濃縮。通過
15 在矽膠上進行的中壓液相色譜(己烷中 0 至 100%梯度的
乙酸乙酯作為洗脫液)對所得殘餘物進行純化，從而
得到標題化合物(本發明化合物)的油狀物(0.085 g)。
1H NMR (CDCl₃) δ 1.75-1.90 (m, 2H), 2.15-2.27 (m, 2H),
2.82 (m, 1H), 2.99 (s, 3H), 3.20 (m, 1H), 3.33 (m, 1H),
3.62 (m, 1H), 3.75-3.95 (m, 2H), 4.29 (m, 2H), 4.58 (m,
20 1H), 6.07 (m, 1H), 6.35 (m, 1H), 6.90 (m, 2H), 7.30 (m,
1H), 7.66 (s, 1H)。

實例 5

2,2,2-三氟乙酸 2-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]-2-甲基胍(化合物 36) 的製備

在 0°C 下向 1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-(1-甲基胍基)乙酮(即實例 4 步驟 A 的產物)(包括殘餘四氫呋喃, 重 0.29 g) 和三乙胺(103 μ L, 0.74 mmol)在二氯甲烷(2 mL)中的混合物加入三氟乙酸酐(0.097 mL, 0.70 mmol)。讓反應混合物升溫至室溫、攪拌過夜, 然後用二氯甲烷稀釋。將有機層用水和飽和氯化鈉水溶液洗滌、用硫酸鎂乾燥、過濾並減壓濃縮。通過在矽膠上進行的中壓液相色譜(己烷中 0 至 100%梯度的乙酸乙酯作為洗脫液)對所得殘餘物進行純化, 從而得到標題化合物(本發明化合物)的白色泡沫狀固體(0.10 g)。

^1H NMR (CDCl_3) δ 1.75-1.90 (m, 2H), 2.15-2.27 (m, 2H), 2.80-2.90 (m, 4H), 3.20 (m, 1H), 3.33 (m, 1H), 3.62 (m, 1H), 3.75-3.90 (m, 4H), 4.60 (m, 1H), 6.07 (m, 1H), 6.92 (m, 2H), 7.30 (m, 1H), 7.65 (m, 1H), 9.45 (s, 1H)。

實例 6

N-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙氧基]-2,2,2-三氟乙醯胺(化合物 38) 的製備

步驟 A： *N*-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙氧基]-2,2-二甲基丙醯胺的製備

在 0°C 下向氫化鈉 (80 mg, 2.0 mmol, 在礦物油中
5 為 60%) 和 *N,N*-二甲基甲醯胺的混合物加入 1,1-二甲基
乙基 *N*-羥基胺基甲酸酯 (146 mg, 1.1 mmol) 在 *N,N*-二甲
基甲醯胺 (1 mL) 中的溶液。在 0°C 下攪拌該反應混合物
30 分鐘，然後加入 2-氯-1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-
10 二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]乙酮 (即實例 2
步驟 A 的產物) (0.43 g, 1.0 mmol) 在 *N,N*-二甲基甲醯胺
(2 mL) 中的溶液。讓反應混合物升溫至室溫並攪拌 2 小
時，然後緩慢加入水 (5 mL)。用乙酸乙酯萃取該混合
物，將有機層用檸檬酸溶液 (也稱為 2-羥基-1,2,3-丙烷
15 三羧酸) (在水中為 20%) 和飽和碳酸氫鈉溶液洗滌、
用硫酸鎂乾燥、過濾和減壓濃縮。通過在矽膠上進行的
中壓液相色譜 (己烷中 0 至 100% 梯度的乙酸乙酯作為
洗脫液) 對所得殘餘物進行純化，從而得到標題化合物的
油狀物 (0.37 g)。

¹H NMR (CDCl₃): δ 1.47 (s, 9H), 1.8 (m, 2H), 2.2 (m, 2H),
20 2.85 (m, 1H), 3.20 (m, 1H), 3.30 (m, 1H), 3.60-3.67 (m,
1H), 3.75-3.83 (m, 1H), 4.57 (s, 2H), 4.60 (m, 1H),
6.03-6.13 (m, 1H), 6.88-6.96 (m, 2H), 7.25-7.36 (m, 1H),
7.66 (s, 1H), 8.19 (s, 1H)。

步驟 B： 2-(胺基氧基)-1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]乙酮的製備

向 *N*-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙氧基]-2,2-二甲基丙醯胺(即步驟 A 的產物)(0.37 g, 0.71 mmol)在甲醇(5 mL)中的混合物加入鹽酸溶液(在二乙醚中為 2 M, 3.6 mL)。3 小時後, 將反應混合物在減壓下濃縮, 並在二氯甲烷和飽和碳酸氫鈉水溶液之間分配。將有機層用硫酸鎂乾燥、過濾並減壓濃縮, 從而得到標題化合物的泡沫狀白色固體(0.20 g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): δ 1.8 (m, 2H), 2.2 (m, 2H), 2.85 (m, 1H), 3.15 (m, 1H), 3.30 (m, 1H), 3.60-3.67 (m, 1H), 3.70-3.83 (m, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.63 (m, 1H), 5.93 (br s, 2H), 6.10 (m, 1H), 6.88-6.96 (m, 2H), 7.25-7.36 (m, 1H), 7.66 (s, 1H)。

步驟 C： *N*-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙氧基]-2,2,2-三氟乙醯胺的製備

在 0°C 下向 2-(胺基氧基)-1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]乙酮(即步驟 B 的產物)(0.20 g, 0.47 mmol)和三乙胺(0.073 mL, 0.52 mmol)在二氯甲烷(2 mL)中的混合物加入三氟乙酸酐(0.065 mL, 0.47 mmol)。讓反應混合物升溫至室溫並

攪拌過夜。將更多的三乙胺(0.095 mL, 0.68 mmol)和三
氟乙酸酐(0.044 mL, 0.32 mmol)加入該反應混合物中。2
小時後，將反應混合物用二氯甲烷稀釋，然後用鹽酸(0.1
N)、飽和碳酸氫鈉水溶液和飽和氯化鈉水溶液洗滌，並
5 用硫酸鎂乾燥、過濾和減壓濃縮，從而得到標題化合物
(本發明化合物)的油狀物(0.14 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 1.8 (m, 2H), 2.2 (m, 2H), 2.95 (m,
1H), 3.15 (m 1H), 3.33 (m, 1H), 3.55-3.70 (m, 2H),
3.70-3.83 (m, 1H), 4.55 (m, 1H), 4.75 (s, 2H), 6.04 (m,
10 1H), 6.88-6.96 (m, 2H), 7.5 和 7.7 (m, 1H), 7.65 (s, 1H)。

實例 7

1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑
基]-1-哌啶基]-2-(4,5-二氫-3,5-二甲基-1*H*-吡唑-1-基]乙酮
15 (化合物 40) 的製備

步驟 A: 4,5-二氫-3,5-二甲基-1*H*-吡唑-1-乙酸乙酯的製
備

在室溫下將胍基乙酸乙酯鹽酸鹽(1.55 g, 10
mmol)、3-戊烯-2-酮(0.95 mL, 10 mmol)和碳酸氫鈉(1.00
g, 11.9 mmol)在乙醇(10 mL)中的混合物攪拌過夜。然後
將反應混合物過濾並減壓濃縮。通過在矽膠上進行的中
壓液相色譜(己烷中 0 至 100%梯度的乙酸乙酯作為洗
脫液)對所得油狀物進行純化，從而得到標題化合物的
20 黃色油狀物(0.26 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 1.27 (m, 6 H), 1.94 (s, 3H), 2.35 (m, 1H), 2.75 (m, 1H), 3.42 (m, 1H), 3.60-3.85 (m 2H), 4.20 (m, 2H)。

5 步驟 B： 4,5-二氫-3,5-二甲基-1*H*-吡啶-1-乙酸的製備

在室溫下將 4,5-二氫-3,5-二甲基-1*H*-吡啶-1-乙酸乙酯（即步驟 A 的產物）(0.26 g, 0.0014 mol)和氫氧化鋰(0.072 g, 3 mmol)在甲醇(2 mL)、四氫呋喃(2 mL)和水(2 mL)的溶液中的混合物攪拌過夜。將飽和氯化銨水溶液加入該反應混合物中，並將該混合物在減壓下濃縮。將所得殘餘物溶解於乙酸乙酯中，並減壓濃縮有機層，從而得到標題化合物的無色油狀物(0.10 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 1.29 (d, 3 H), 1.97 (s, 3H), 2.37 (m, 1H), 2.77 (m, 1H), 3.3 (m, 1H), 3.5-3.8 (m 2H), 8.15 (m, 1H)。

步驟 C： 1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-(4,5-二氫-3,5-二甲基-1*H*-吡啶-1-基]乙酮的製備

20 將 4,5-二氫-3,5-二甲基-1*H*-吡啶-1-乙酸（即步驟 B 的產物）(0.10 g, 0.64 mmol)、4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]哌啶（即實例 1 步驟 D 的產物）(175 mg, 0.5 mmol)、*N*3-(乙基碳二亞胺)-*N*1,*N*1-二甲基-1,3-丙二胺鹽酸鹽(191 mg, 1.0 mmol)、1-羥基苯并三唑(5 mg, 0.037 mmol)和三乙胺(0.14 mL, 1.0 mmol)

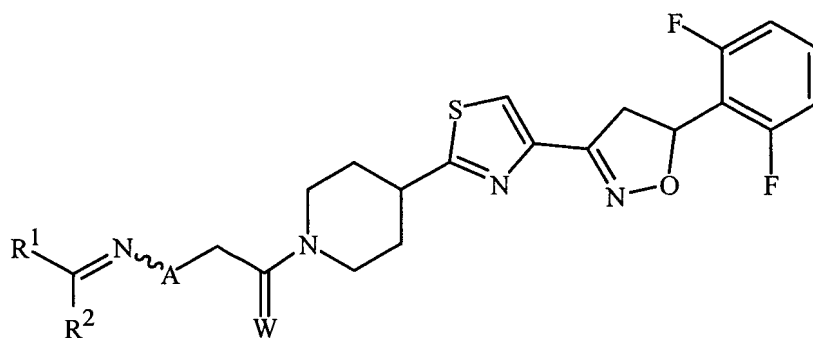
25

在二氯甲烷(4 mL)中的混合物在室溫下攪拌。6 小時後，將更多 *N*3-(乙基碳二亞胺)-*N*1,*N*1-二甲基-1,3-丙二胺鹽酸鹽(191 mg, 1.0 mmol)和三乙胺(0.14 mL, 1.0 mmol)加入該反應混合物中。3 天後，將該反應混合物用二氯甲烷稀釋，用飽和氯化銨水溶液洗滌並減壓濃縮。通過在矽膠上進行的中壓液相色譜(將己烷中 0 至 100%梯度的乙酸乙酯，接著為乙酸乙酯中 20%的甲醇作為洗脫液)對所得殘餘物進行純化，從而得到標題化合物(本發明化合物)的棕褐色固體(124 mg)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): δ 1.25 (m, 3H), 1.65-1.90 (m, 2H), 1.93 (s, 3H), 2.10-2.25 (m, 2H), 2.35 (m, 1H), 2.80 (m, 2H), 3.15-3.45 (m, 3H), 3.50-4.05 (m, 4H), 4.30 (m, 1H), 4.66 (m, 1H), 6.07 (m, 1H), 6.92 (m, 2H), 7.30 (m, 1H), 7.66 (s, 1H)。

通過本文所描述的程序，連同本領域已知的方法，可製備如下表 1 至 21 的化合物。表中使用了如下縮寫，即：*t* 指三級，*s* 指二級，*n* 指正，*i* 指異，*c* 指環，Me 指甲基，Et 指乙基，Pr 指丙基，*i*-Pr 指異丙基，*c*-Pr 指環丙基，Bu 指丁基，*c*-Bu 指環丁基，CN 指氰基與 Ph 指苯基。

表 1



W 為 O。

R ¹	R ²	A	R ¹	R ²	A
Me	Me	-O-	CF ₃	CF ₃	-O-
Me	Me	-S-	CF ₃	CH ₂ Cl	-O-
Me	Me	-NH-	CF ₃	Cl	-O-
Me	Me	-N(Me)-	CF ₃	Br	-O-
Me	Me	-CH ₂ -	CF ₃	MeO	-O-
Me	Me	-C(Me) ₂ -	CF ₃	EtO	-O-
Me	Me	-OCH ₂ -	CF ₃	CF ₃ O	-O-
Me	Me	-SCH ₂ -		-CH ₂ CH ₂ -	-O-
Me	Me	-NHCH ₂ -		-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	-O-
Me	Me	-N(Me)CH ₂ -		-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	-O-
Me	H	-O-		-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -	-O-
Et	H	-O-		-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	-O-
<i>n</i> -Pr	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-O-
<i>i</i> -Pr	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-O-
<i>n</i> -Bu	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Et	-O-
<i>i</i> -Bu	H	-O-	CF ₃ CH ₂	CN	-O-
<i>t</i> -Bu	H	-O-	CF ₃ CH ₂	CF ₃	-O-
己基	H	-O-	CF ₃ CH ₂	CH ₂ Cl	-O-
H	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Cl	-O-
CN	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Br	-O-
NH ₂	H	-O-	CF ₃ CH ₂	MeO	-O-
HC(=O)	H	-O-	CF ₃ CH ₂	EtO	-O-
HOC(=O)	H	-O-	CF ₃ CH ₂	CF ₃ O	-O-
H ₂ NC(=O)	H	-O-	Me	Et	-O-
CH ₂ =CH	Me	-O-	Me	<i>n</i> -Pr	-O-
CH ₂ =CHCH ₂	H	-O-	Me	<i>i</i> -Pr	-O-
CH CCH ₂	H	-O-	Me	CN	-O-
CF ₃	H	-O-	Me	CF ₃	-O-
CF ₃	Me	-O-	Me	CH ₂ Cl	-O-
CF ₃ CH ₂	H	-O-	Me	Cl	-O-
CF ₃ CH ₂	Me	-O-	Me	Br	-O-

W 為 O。

R ¹	R ²	A	R ¹	R ²	A
ClCH ₂ CH ₂	H	-O-	Me	MeO	-O-
<i>c</i> -Pr	H	-O-	Me	EtO	-O-
<i>c</i> -戊基	H	-O-	Me	CF ₃ O	-O-
<i>c</i> -己基	H	-O-	CF ₃	H	-S-
1-F- <i>c</i> -Pr	H	-O-	CF ₃	H	-NH-
CF ₂ =CF	H	-O-	CF ₃	H	-N(Me)-
<i>c</i> -PrCH ₂	H	-O-	CF ₃	H	-CH ₂ -
CH ₃ OCH ₂	H	-O-	CF ₃	H	-C(Me) ₂ -
CH ₃ SCH ₂	H	-O-	CF ₃	H	-OCH ₂ -
CH ₃ S(=O)CH ₂	H	-O-	CF ₃	H	-SCH ₂ -
CH ₃ S(=O) ₂ CH ₂	H	-O-	CF ₃	H	-NHCH ₂ -
(CH ₃) ₂ NCH ₂	H	-O-	CF ₃	H	-N(Me)CH ₂ -
CH ₃ C(=O)	H	-O-	CF ₃	Me	-S-
CF ₃ C(=O)	H	-O-	CF ₃	Me	-NH-
<i>c</i> -PrC(=O)	H	-O-	CF ₃	Me	-N(Me)-
CH ₃ OC(=O)	H	-O-	CF ₃	Me	-CH ₂ -
MeNHC(=O)	H	-O-	CF ₃	Me	-C(Me) ₂ -
(Me) ₂ NC(=O)	H	-O-	CF ₃	Me	-OCH ₂ -
MeO	H	-O-	CF ₃	Me	-SCH ₂ -
EtO	H	-O-	CF ₃	Me	-NHCH ₂ -
<i>i</i> -PrO	H	-O-	CF ₃	Me	-N(Me)CH ₂ -
CF ₃ O	H	-O-	CCl ₃	H	-O-
<i>c</i> -BuO	H	-O-	CCl ₃	Me	-O-
CH ₂ =CHCH ₂ O	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-S-
CH CCH ₂ O	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-NH-
MeOCH ₂ CH ₂ O	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-N(Me)-
CH ₃ C(=O)O	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-CH ₂ -
CF ₃ C(=O)O	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-C(Me) ₂ -
MeS	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-OCH ₂ -
CF ₃ S	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-SCH ₂ -
<i>c</i> -PrS	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-NHCH ₂ -
MeNH	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-N(Me)CH ₂ -
(Me) ₂ N	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-S-
ClCH ₂ CH ₂ NH	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-NH-
CH ₃ C(=O)NH	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-N(Me)-
CF ₃ C(=O)NH	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-CH ₂ -
CH ₃ S(=O) ₂ NH	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-C(Me) ₂ -
CF ₃ S(=O) ₂ NH	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-OCH ₂ -

W 為 O。

W 為 O。

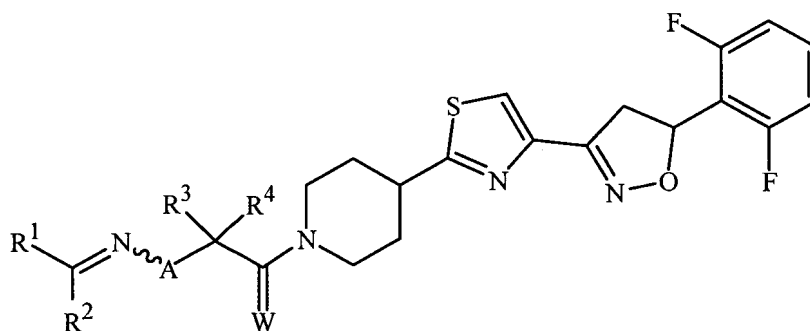
R ¹	R ²	A	R ¹	R ²	A
Cl	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-SCH ₂ -
CF ₃	Et	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-NHCH ₂ -
CF ₃	<i>n</i> -Pr	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-N(Me)CH ₂ -
CF ₃	<i>i</i> -Pr	-O-	CF ₃	H	-OCH(Me)-
CF ₃	CN	-O-	CF ₃	H	-CH(CF ₃)-

W 為 S。

R ¹	R ²	A	R ¹	R ²	A
Me	Me	-O-	CF ₃	Me	-O-
CF ₃	H	-O-	CF ₃	H	-NH-

表 2

5

R² 為 H, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
CF ₃	Me
CF ₃	Et
CF ₃	<i>n</i> -Pr
CF ₃	<i>i</i> -Pr
CF ₃	<i>i</i> -Bu
CF ₃	CN
CF ₃	Cl
CF ₃	CH ₂ =CHCH ₂
CF ₃	CH CCH ₂
CF ₃	CF ₃

R² 為 H, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
CF ₃ CH ₂	MeC(=O)
CF ₃ CH ₂	MeOC(=O)
CF ₃ CH ₂	EtOC(=O)
CF ₃ CH ₂	MeNHC(=O)
CF ₃ CH ₂	(Me) ₂ NC(=O)
CF ₃ CH ₂	Cl
CF ₃ CH ₂	CN
CF ₃ CH ₂	CH ₃ S
CF ₃ CH ₂	Ph
CF ₃ CH ₂	2,5-di-Cl-Ph

R² 為 H, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
CF ₃	MeOCH ₂
CF ₃	CH ₃ SCH ₂
CF ₃	CH ₃ S(=O)CH ₂
CF ₃	CH ₃ S(=O) ₂ CH ₂
CF ₃	MeC(=O)
CF ₃	EtC(=O)
CF ₃	CF ₃ C(=O)
CF ₃	MeOC(=O)
CF ₃	EtOC(=O)
CF ₃	MeNHC(=O)
CF ₃	(Me) ₂ NC(=O)
CF ₃	MeO
CF ₃	EtO
CF ₃	CF ₃ O
CF ₃	MeS
CF ₃	CF ₃ S
CF ₃	CH ₃ S(=O)
CF ₃	CH ₃ S(=O) ₂
CF ₃	CF ₃ S(=O) ₂
CF ₃	MeC(=O)O
CF ₃	CF ₃ C(=O)O
CF ₃	Ph
CF ₃	2,5-di-Cl-Ph
CF ₃	2-Cl-5-CF ₃ -Ph
CF ₃	2,5-di-Me-Ph
CF ₃	2-Me-5-CF ₃ -Ph
CF ₃	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	5-Cl-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	5-Br-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	5-Et-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	3,5-di-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-5-基
CF ₃	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪唑-2-基
CF ₃	3,5-di-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
CF ₃	3,5-di-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
CF ₃ CH ₂	Me
CF ₃ CH ₂	Et

R² 為 H, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
CF ₃ CH ₂	2-Cl-5-CF ₃ -Ph
CF ₃ CH ₂	2,5-di-Me-Ph
CF ₃ CH ₂	2-Me-5-CF ₃ -Ph
CF ₃ CH ₂	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	5-Cl-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	5-Br-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	5-Et-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	3,5-di-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-5-基
CF ₃ CH ₂	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪唑-2-基
CF ₃ CH ₂	3,5-di-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
CF ₃ CH ₂	3,5-di-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
Me	Me
Me	Et
Me	MeO
Me	EtO
Me	MeC(=O)
Me	MeOC(=O)
Me	EtOC(=O)
Me	MeNHC(=O)
Me	(Me) ₂ NC(=O)
Me	Cl
Me	CN
Me	MeS
Me	Ph
Me	2,5-di-Cl-Ph
Me	2-Cl-5-CF ₃ -Ph
Me	2,5-di-Me-Ph
Me	2-Me-5-CF ₃ -Ph
Me	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡啶-1-基
Me	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
Me	5-Cl-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
Me	5-Br-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
Me	5-Et-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
Me	3,5-di-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
Me	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-5-基
Me	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪唑-2-基

R² 為 H, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
CF ₃ CH ₂	MeO
CF ₃ CH ₂	EtO

R² 為 H, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
Me	3,5-di-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
Me	3,5-di-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基

R² 為 Me, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
CF ₃	Me
CF ₃	Et
CF ₃	MeO
CF ₃	EtO
CF ₃	MeC(=O)
CF ₃	MeOC(=O)
CF ₃	EtOC(=O)
CF ₃	MeNHC(=O)
CF ₃	(Me) ₂ NC(=O)
CF ₃	Cl
CF ₃	CN
CF ₃	MeS
CF ₃	Ph
CF ₃	2,5-di-Cl-Ph
CF ₃	2-Cl-5-CF ₃ -Ph
CF ₃	2,5-di-Me-Ph
CF ₃	2-Me-5-CF ₃ -Ph
CF ₃	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	5-Cl-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	5-Br-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	5-Et-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	3,5-di-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-5-基
CF ₃	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪唑-2-基
CF ₃	3,5-di-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
CF ₃	3,5-di-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
Me	Me
Me	Et
Me	MeO
Me	EtO
Me	MeC(=O)
Me	MeOC(=O)

R² 為 Me, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
Me	2-Cl-5-CF ₃ -Ph
Me	2,5-di-Me-Ph
Me	2-Me-5-CF ₃ -Ph
Me	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡唑-1-基
Me	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
Me	5-Cl-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
Me	5-Br-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
Me	5-Et-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
Me	3,5-di-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
Me	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-5-基
Me	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪唑-2-基
Me	3,5-di-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
Me	3,5-di-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
CF ₃ CH ₂	Me
CF ₃ CH ₂	Et
CF ₃ CH ₂	MeO
CF ₃ CH ₂	EtO
CF ₃ CH ₂	MeC(=O)
CF ₃ CH ₂	MeOC(=O)
CF ₃ CH ₂	EtOC(=O)
CF ₃ CH ₂	MeNHC(=O)
CF ₃ CH ₂	(Me) ₂ NC(=O)
CF ₃ CH ₂	Cl
CF ₃ CH ₂	CN
CF ₃ CH ₂	MeS
CF ₃ CH ₂	Ph
CF ₃ CH ₂	2,5-di-Cl-Ph
CF ₃ CH ₂	2-Cl-5-CF ₃ -Ph
CF ₃ CH ₂	2,5-di-Me-Ph
CF ₃ CH ₂	2-Me-5-CF ₃ -Ph
CF ₃ CH ₂	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃ CH ₂	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃ CH ₂	5-Cl-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基

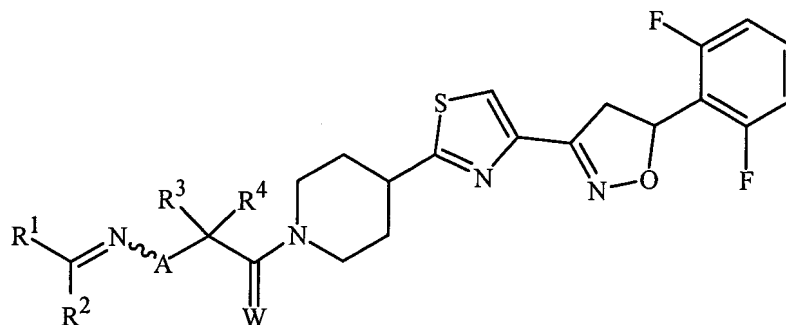
R² 為 Me, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
Me	EtOC(=O)
Me	MeNHC(=O)
Me	(Me) ₂ NC(=O)
Me	Cl
Me	CN
Me	MeS
Me	Ph
Me	2,5-di-Cl-Ph

R² 為 Me, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
CF ₃ CH ₂	5-Br-3-CF ₃ -1H-吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	5-Et-3-CF ₃ -1H-吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	3,5-di-CF ₃ -1H-吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	1-Me-3-CF ₃ -1H-吡啶-5-基
CF ₃ CH ₂	1-Me-4-CF ₃ -1H-咪唑-2-基
CF ₃ CH ₂	3,5-di-Cl-1H-1,2,4-三唑-1-基
CF ₃ CH ₂	3,5-di-Br-1H-1,2,4-三唑-1-基

表 2A



5

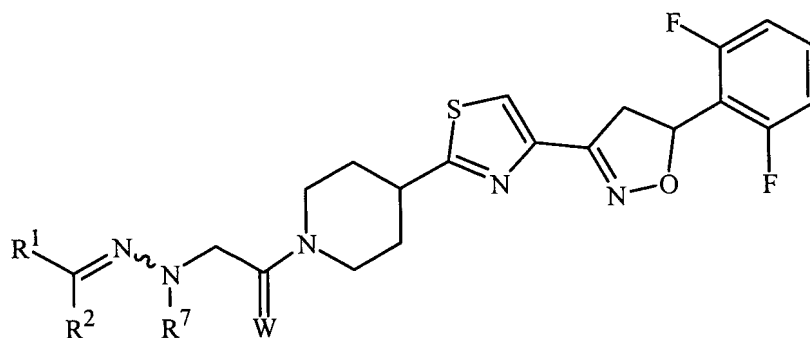
W 為 O。

R ¹	R ²	A	R ³	R ⁴
CF ₃	H	-OCH ₂ -	OH	H
CF ₃	H	-O-	Me	Me
CF ₃	H	-O-	Me	Et
CF ₃	H	-O-	H	CF ₃
CF ₃	H	-N(Et)-	H	H
CF ₃	H	-N(<i>n</i> -Pr)-	H	H
CF ₃	H	-N(<i>i</i> -Pr)-	H	H
CF ₃	H	-N(<i>n</i> -Bu)-	H	H
CF ₃	H	-N(CN)-	H	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₂ Cl)-	H	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ OCH ₃)-	H	H
CF ₃	H	-N(SCH ₂ OCH ₃)-	H	H
CF ₃	H	-N(C(=O)Me)-	H	H
CF ₃	H	-N(C(=O)CF ₃)-	H	H

W 為 O。

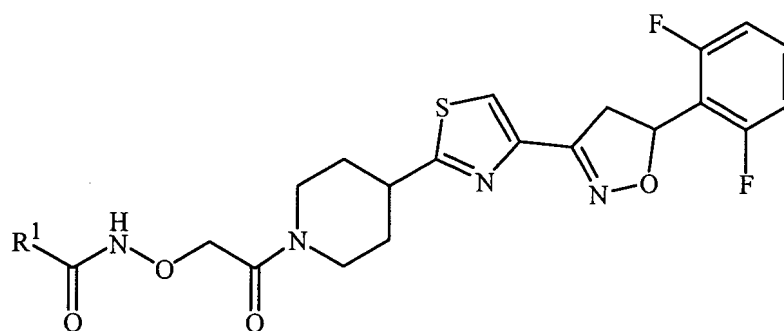
R ¹	R ²	A	R ³	R ⁴
CF ₃	H	-N(C(=O)OMe)-	H	H
CF ₃	H	-N(C(=O)NHMe)-	H	H
CF ₃	H	-N(C(=O)NMe ₂)-	H	H
CF ₃	H	-N(S(=O) ₂ Me)-	H	H
CF ₃	H	-N(S(=O) ₂ CF ₃)-	H	H
CF ₃	Me	-N(Et)-	H	H
CF ₃	Me	-N(<i>n</i> -Pr)-	H	H
CF ₃	Me	-N(<i>i</i> -Pr)-	H	H
CF ₃	Me	-N(<i>n</i> -Bu)-	H	H
CF ₃	Me	-N(CN)-	H	H
Me	Me	-N(Et)-	H	H
Me	Me	-N(<i>n</i> -Pr)-	H	H
Me	Me	-N(<i>i</i> -Pr)-	H	H
Me	Me	-N(<i>n</i> -Bu)-	H	H
Me	Me	-N(CN)-	H	H
Me	H	-N(Et)-	H	H
Me	H	-N(<i>n</i> -Pr)-	H	H
Me	H	-N(<i>i</i> -Pr)-	H	H
Me	H	-N(<i>n</i> -Bu)-	H	H
Me	H	-N(CN)-	H	H
CF ₃ CH ₂	H	-N(Et)-	H	H
CF ₃ CH ₂	H	-N(<i>n</i> -Pr)-	H	H
CF ₃ CH ₂	H	-N(<i>i</i> -Pr)-	H	H
CF ₃ CH ₂	H	-N(<i>n</i> -Bu)-	H	H
CF ₃ CH ₂	H	-N(CN)-	H	H

表 3



W 為 O。			W 為 O。			W 為 O。		
R ¹	R ²	R ⁷	R ¹	R ²	R ⁷	R ¹	R ²	R ⁷
CF ₃	-CH ₂ CH ₂ -		CF ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
CF ₃	-CH ₂ CH(Me)-		CF ₃	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-		Me	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	
CF ₃	-CH ₂ C(Me) ₂ -		CF ₃	-OC(=O)-H ₂ -		Me	-CH(CHCF ₃)-	
CF ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Me	-CH ₂ CH(Me)-		Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	
Me	-CH ₂ CH ₂ -		Me	-CH ₂ C(Me) ₂ -		Me	-CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)-	
Me	-OC(Me) ₂ -							

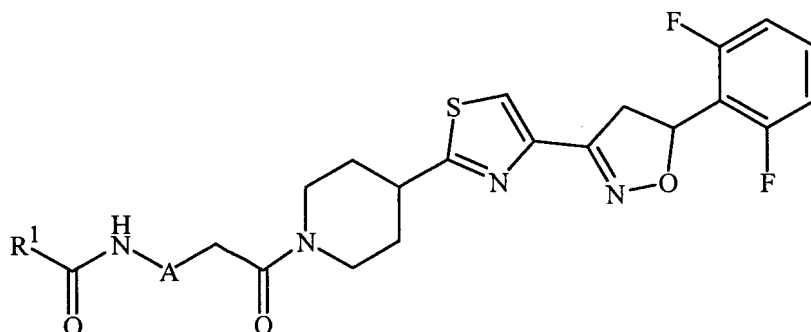
表 4



5

R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
Me	CH ₂ =CHCH ₂	(Me) ₂ NCH ₂	MeOCH ₂ CH ₂ O
Et	CH CCH ₂	MeC(=O)	<i>c</i> -戊基
<i>n</i> -Pr	CF ₃	CF ₃ C(=O)	CH ₃ C(=O)O
<i>i</i> -Pr	CF ₃ CH ₂	<i>c</i> -PrC(=O)	CF ₃ C(=O)O
<i>n</i> -Bu	ClCH ₂ CH ₂	MeOC(=O)	MeS
<i>i</i> -Bu	<i>c</i> -Pr	MeNHC(=O)	CF ₃ S
<i>t</i> -Bu	<i>c</i> -己基	(Me) ₂ NC(=O)	<i>c</i> -PrS
己基	1-F- <i>c</i> -Pr	MeO	MeNH
H	CF ₂ =CF	EtO	(Me) ₂ N
CN	<i>c</i> -PrCH ₂	<i>i</i> -PrO	ClCH ₂ CH ₂ NH
NH ₂	MeOCH ₂	CF ₃ O	CH ₃ C(=O)ONH
HC(=O)	MeSCH ₂	<i>c</i> -BuO	CF ₃ C(=O)ONH
HOC(=O)	CH ₃ S(=O)CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂ O	MeS(=O) ₂ NH
CH ₂ =CH	CH ₃ S(=O) ₂ CH ₂	CH CCH ₂ O	CF ₃ S(=O) ₂ NH

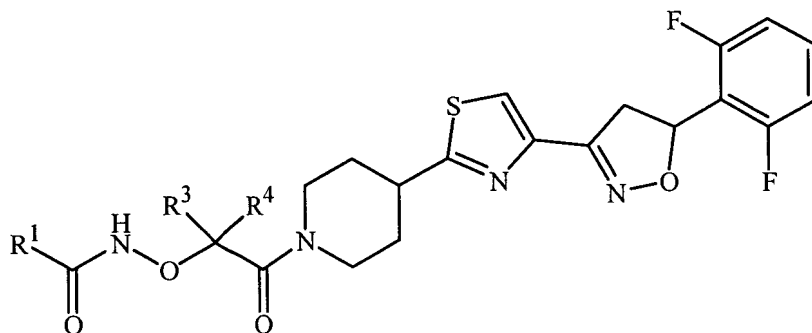
表 5



5

R ¹	A	R ¹	A	R ¹	A	R ¹	A
CF ₃	-S-	CF ₃	-OCH ₂ -	Me	-NH-	Me	-N(CN)-
CF ₃	-NH-	CF ₃	-SCH ₂ -	Me	-NMe-	Me	-SCH ₂ -
CF ₃	N(Me)-	CF ₃	-NHCH ₂ -	Me	-CH ₂ -	Me	-NHCH ₂ -
CF ₃	-CH ₂ -	CF ₃	-N(Me)CH ₂ -	Me	-C(Me) ₂ -	Me	-N(Me)CH ₂ -
CF ₃	-C(Me) ₂ -	Me	-S-	Me	-OCH ₂ -	CF ₃	-OCH(Me)-
CF ₃	-O-	CF ₃	-N(CH ₂ CH ₂ Cl)-	CF ₃	-N(S(=O) ₂ Me)-	CF ₃	-CH(CF ₃)-
CF ₃	-N(Et)-	CF ₃	-N(CH ₂ OMe)-	CF ₃	-N(S(=O) ₂ CF ₃)-		
CF ₃	-N(<i>n</i> -Pr)-	CF ₃	-N(SCH ₂ OMe)-	Me	-N(Et)-		
CF ₃	-N(<i>i</i> -Pr)-	CF ₃	-N(C(=O)Me)-	Me	-N(<i>n</i> -Pr)		
CF ₃	-N(<i>n</i> -Bu)-	CF ₃	-N(C(=O)OMe)-	Me	-N(<i>n</i> -Bu)-		
CF ₃	-N(CN)-	CF ₃	-N(C(=O)NHMe)-				

表 6

R⁴ 為 H。R⁴ 為 H。R⁴ 為 H。

R ¹	R ³	R ¹	R ³	R ¹	R ³
CF ₃	Me	CF ₃	MeS	Me	EtO
CF ₃	Et	CF ₃	CF ₃ S	Me	MeC(=O)
CF ₃	<i>n</i> -Pr	CF ₃	MeS(=O)	Me	MeOC(=O)
CF ₃	<i>i</i> -Pr	CF ₃	MeS(=O) ₂	Me	EtOC(=O)
CF ₃	<i>i</i> -Bu	CF ₃	CF ₃ S(=O) ₂	Me	MeNHC(=O)
CF ₃	CN	CF ₃	MeC(=O)O	Me	Me ₂ NC(=O)
CF ₃	Cl	CF ₃	Ph	Me	Cl
CF ₃	CH ₂ =CHCH ₂	CF ₃	2,5-di-Cl-Ph	Me	CN
CF ₃	CH CCH ₂	CF ₃	2-Cl-5-CF ₃ -Ph	Me	MeS
CF ₃	CF ₃	CF ₃	2,5-di-Me-Ph	Me	Ph
CF ₃	MeOCH ₂	CF ₃	2-Me-5-CF ₃ -Ph	Me	2,5-di-Cl-Ph
CF ₃	CH ₃ SCH ₂	CF ₃	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡啶-1-基	Me	2-Cl-5-CF ₃ -Ph
CF ₃	MeS(=O)CH ₂	CF ₃	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基	Me	2,5-di-Me-Ph
CF ₃	MeS(=O) ₂ CH ₂	CF ₃	5-Cl-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基	Me	2-Me-5-CF ₃ -Ph
CF ₃	MeC(=O)	CF ₃	5-Br-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基	Me	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	EtC(=O)	CF ₃	5-Et-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基	Me	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	CF ₃ C(=O)	CF ₃	3,5-di-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基	Me	5-Cl-3-(CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	MeOC(=O)	CF ₃	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-5-基	Me	5-Br-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	EtOC(=O)	CF ₃	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪唑-2-基	Me	5-Et-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	MeNHC(=O)	CF ₃	3,5-di-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基	Me	3,5-di-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	Me ₂ NC(=O)	CF ₃	3,5-di-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基	Me	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-5-基
CF ₃	MeO	Me	Me	Me	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪唑-2-基
CF ₃	EtO	Me	Et	Me	3,5-di-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
CF ₃	CF ₃ O	Me	MeO	Me	3,5-di-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基

R⁴ 為 Me。

R ¹	R ³
CF ₃	Me

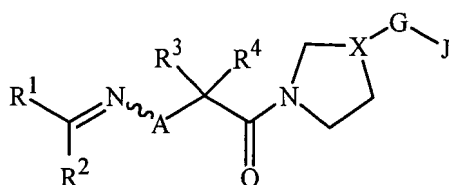
R⁴ 為 Et。

R ¹	R ³
CF ₃	Me

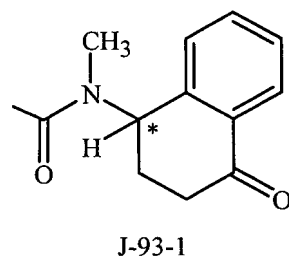
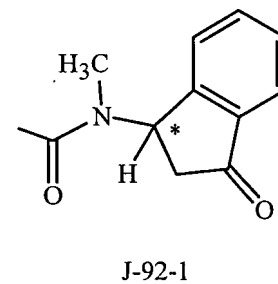
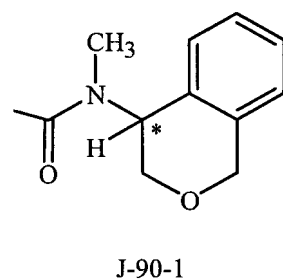
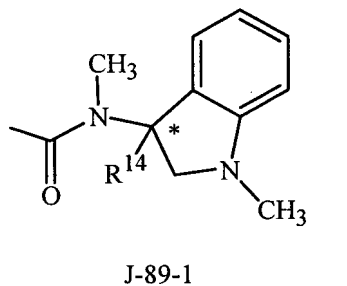
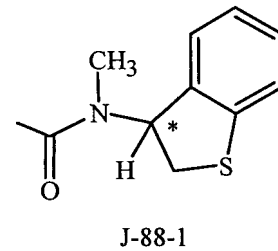
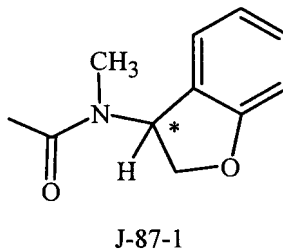
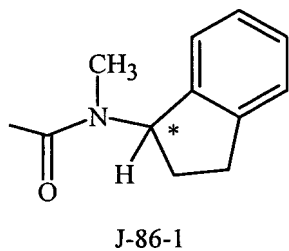
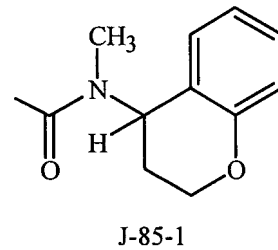
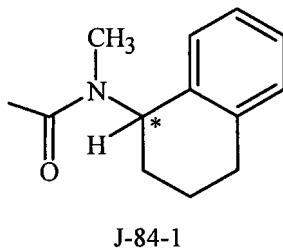
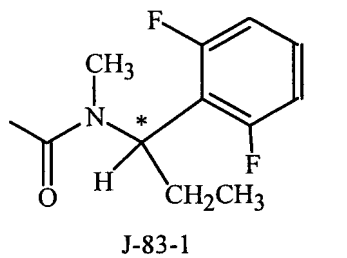
R⁴ 為 CF₃。

R ¹	R ³
CF ₃	H

表 7



在表 8 中，結構 G-1 和 G-2 在上面實施例中的「示例 2」中示出。示例 2 中連接至 G 的取代基 R^{26a} 為 H。結構 J (如 J-29-1) 在上面實施例中的「示例 A」中示出，不同之處在於當 J 為 J-83-1 至 J-93-1 其中之一時，則 J 的結構在下面示出。在結構 J-83-1 至 J-93-1 中，用星號(*)標定的碳原子含有立構中心。



R¹ 為 Me, R² 為 H, A 為 -O-, R³ 為 H, R⁴ 為 H, X 為 X¹, 且 G 為 G-1。

J	J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51	J-83-1
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52	J-84-1
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53	J-85-1

R^1 為 Me, R^2 為 H, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。

J	J	J	J	J	J	J
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54	J-88-1
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55	J-89-1
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-58	J-90-1
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-59	J-92-1
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-60	J-93-1
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-86-1	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-87-1	

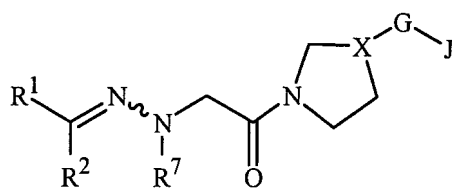
本揭露亦包括表 7A-1 至 7A-77, 各表係如同表 7 建構, 除了表 7 的行頭 (即「 R^1 為 Me, R^2 為 H, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。」) 分別用下列所示行頭代替。例如, 表 7A-1 的行頭為「 R^1 為 Me, R^2 為 H, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。」), 而 J 如同上表 7 所定義。

表	行頭
7A-1	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-2	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-3	R^1 為 Et, R^2 為 H, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-4	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-5	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-6	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-7	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-8	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-9	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 H, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-10	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-11	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-12	R^1 為 Me, R^2 為 H, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-13	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-14	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-15	R^1 為 Et, R^2 為 H, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-16	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-17	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-18	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-19	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-20	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。

表	行頭
7A-21	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 H, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-22	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-23	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-24	R^1 為 Me, R^2 為 H, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-25	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-26	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-27	R^1 為 Et, R^2 為 H, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-28	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-29	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-30	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-31	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-32	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-33	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 H, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-34	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-35	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-36	R^1 為 Me, R^2 為 H, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-37	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-38	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-39	R^1 為 Et, R^2 為 H, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-40	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-41	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-42	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-43	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-44	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 Me, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-45	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 H, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-46	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-47	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-48	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^2 , 且 G 為 G-1。
7A-49	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^2 , 且 G 為 G-1。
7A-50	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^2 , 且 G 為 G-1。
7A-51	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^2 , 且 G 為 G-1。
7A-52	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^2 , 且 G 為 G-1。
7A-53	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^2 , 且 G 為 G-1。
7A-54	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^2 , 且 G 為 G-1。

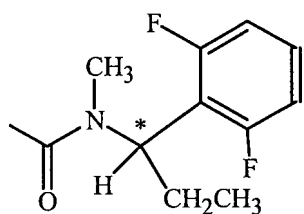
表	行頭
7A-55	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -N(Et)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-1。
7A-56	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -O-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
7A-57	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -O-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
7A-58	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -NH-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
7A-59	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -NH-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
7A-60	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -N(Me)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
7A-61	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -N(Me)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
7A-62	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -N(Et)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
7A-63	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -N(Et)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
7A-64	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -O-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-65	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -O-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-66	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -NH-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-67	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -NH-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-68	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -N(Me)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-69	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -N(Me)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-70	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -N(Et)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-71	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -N(Et)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-72	R ¹ 為 Me, R ² 為 OH, A 為 -O-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
7A-73	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 OH, A 為 -O-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
7A-74	R ¹ 為 Me, R ² 為 OH, A 為 -NH-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
7A-75	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 OH, A 為 -NH-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
7A-76	R ¹ 為 Me, R ² 為 OH, A 為 -N(Me)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
7A-77	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 OH, A 為 -N(Me)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。

表 8

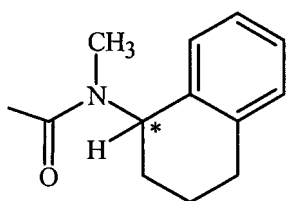


5 在表 8 中，結構 G-1 和 G-2 在上面實施例中的示例 2 中示出。示例 2 中所示連接至 G 的取代基 R^{26a} 為 H。結構 J (如 J-29-1) 在上面實施例中的「示例 A」中示出，不同之處在於當 J 為 J-83-1 至 J-93-1 其中之一時，

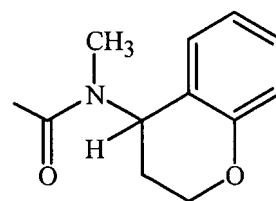
則 J 的結構在下面示出。在結構 J-83-1 至 J-93-1 中，用星號(*)標定的碳原子含有立構中心。



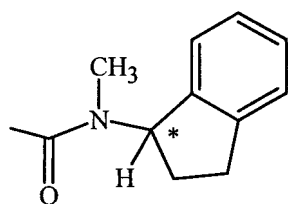
J-83-1



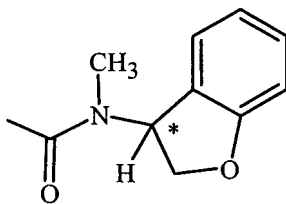
J-84-1



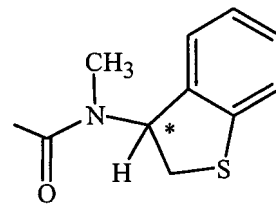
J-85-1



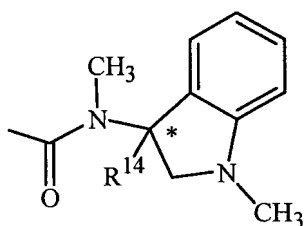
J-86-1



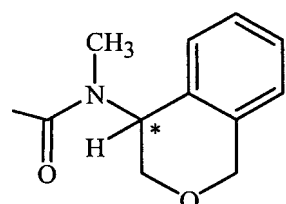
J-87-1



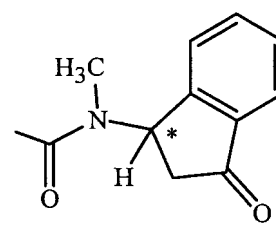
J-88-1



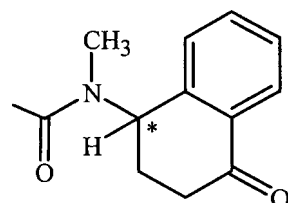
J-89-1



J-90-1



J-92-1



J-93-1

R^1 為 Me, R^2 與 R^{47} 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, X 為 X^1 且 G 為 G-1**。

5

J	J	J	J	J	J	J
---	---	---	---	---	---	---

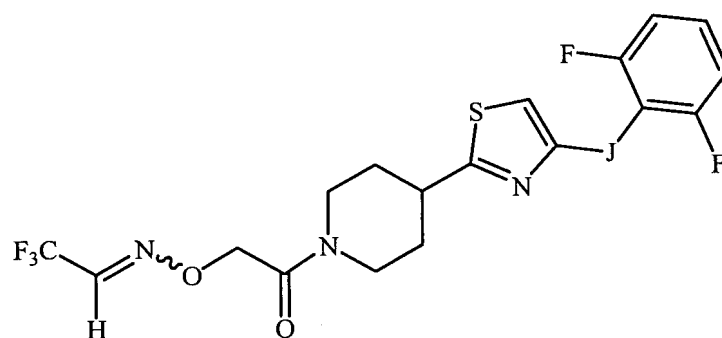
J	J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51	J-85-1
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52	J-86-1
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53	J-87-1
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54	J-88-1
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55	J-89-1
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-58	J-90-1
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-59	J-92-1
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-60	J-93-1
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-83-1	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-84-1	

本揭露亦包括表 8A-1 至 8A-22，各表係如同表 8 建構，除了表 8 的行頭（即「 R^1 為 Me， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-1。」）分別用下列所示行頭代替。例如，表 8A-1 的行頭為「 R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-1。」，而 J 如同上表 8 所定義。

表	行頭
8A-1	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-1。
8A-2	R^1 為 Me， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-1。
8A-3	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-1。
8A-4	R^1 為 Me， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-1。
8A-5	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-1。
8A-6	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^2 ，且 G 為 G-1。
8A-7	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$ ，X 為 X^2 ，且 G 為 G-1。
8A-8	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^2 ，且 G 為 G-1。
8A-9	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-2。
8A-10	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-2。
8A-11	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-2。
8A-12	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^2 ，且 G 為 G-2。
8A-13	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$ ，X 為 X^2 ，且 G 為 G-2。
8A-14	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^2 ，且 G 為 G-2。

表	行頭
8A-15	R ¹ 為 Me, R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
8A-16	R ¹ 為 Me, R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
8A-17	R ¹ 為 Me, R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ² , 且 G 為 G-1。
8A-18	R ¹ 為 Me, R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
8A-19	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
8A-20	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
8A-21	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ² , 且 G 為 G-1。
8A-22	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。

表 9



5

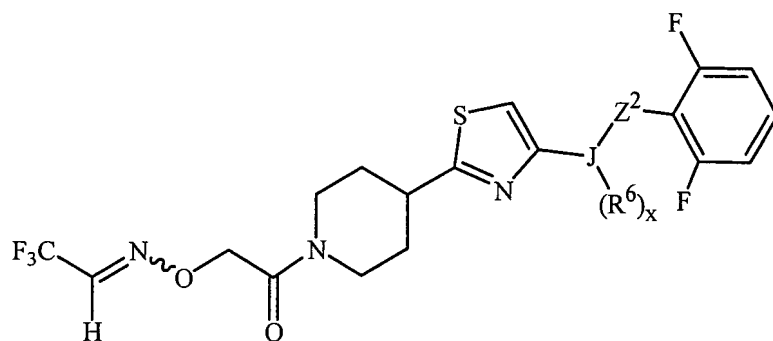
在表 9 中，結構 J (如 J1) 在上面實施例中的示例 3 中示出，其中 x 為 1 且 R⁶ 2,6-二氟苯基如上結構所示。J 後面括號中的數字指 J (噻唑) 環和如上結構 2,6-二氟苯基的連接點。第一個數字為 J 上噻唑環連接的環位置，第二個數字為 J 上與 2,6-二氟苯基環連接的環位置。

10

J	J	J	J	J	J	J
J-1 (2/4)	J-6 (3/1)	J-21 (3/6)	J-27 (5/3)	J-33 (4/2)	J-45 (2/4)	J-73 (4/2)
J-1 (2/5)	J-7 (5/3)	J-21 (5/3)	J-28 (3/5)	J-34 (1/3)	J-45 (2/5)	J-73 (1/3)
J-1 (4/2)	J-7 (3/5)	J-22 (2/4)	J-28 (5/3)	J-34 (1/4)	J-45 (2/6)	J-73 (1/4)
J-1 (5/2)	J-8 (5/3)	J-22 (2/5)	J-29 (3/5)	J-34 (3/5)	J-46 (2/4)	J-73 (4/1)
J-2 (2/4)	J-8 (3/5)	J-22 (4/6)	J-29 (5/3)	J-34 (3/1)	J-46 (2/5)	J-74 (3/5)

J	J	J	J	J	J	J
J-2 (2/5)	J-9 (4/1)	J-22 (4/2)	J-30 (3/5)	J-34 (4/1)	J-46 (4/2)	J-74 (5/3)
J-2 (4/2)	J-10 (3/5)	J-22 (5/2)	J-30 (5/3)	J-35 (4/1)	J-46 (5/2)	J-75 (3/5)
J-2 (5/2)	J-10 (5/3)	J-23 (2/5)	J-30 (3/1)	J-36 (1/3)	J-47 (2/4)	J-75 (5/3)
J-3 (4/1)	J-11 (3/5)	J-23 (2/6)	J-30 (4/1)	J-36 (3/1)	J-47 (2/5)	J-75 (2/4)
J-4 (2/4)	J-11 (5/3)	J-24 (2/4)	J-31 (2/4)	J-36 (3/5)	J-47 (4/2)	J-75 (2/5)
J-4 (2/5)	J-12 (3/1)	J-24 (2/5)	J-31 (2/5)	J-36 (5/3)	J-47 (5/2)	J-76 (3/6)
J-4 (4/2)	J-13 (1/4)	J-24 (4/2)	J-31 (3/5)	J-37 (2/5)	J-48 (3/5)	J-76 (6/3)
J-4 (5/2)	J-13 (4/1)	J-24 (5/2)	J-31 (3/1)	J-37 (5/2)	J-49 (2/4)	J-77 (3/5)
J-4 (3/5)	J-14 (5/3)	J-25 (2/4)	J-31 (4/1)	J-37 (2/4)	J-49 (2/5)	J-77 (5/3)
J-4 (5/3)	J-15 (2/5)	J-25 (2/5)	J-31 (4/2)	J-37 (4/2)	J-49 (4/2)	J-78 (1/3)
J-5 (2/5)	J-16 (2/5)	J-25 (4/2)	J-31 (5/2)	J-38 (2/5)	J-49 (5/2)	J-79 (1/3)
J-5 (4/2)	J-17 (4/2)	J-25 (5/2)	J-32 (2/4)	J-38 (5/2)	J-50 (2/6)	J-79 (3/1)
J-5 (5/2)	J-18 (5/2)	J-26 (2/4)	J-32 (2/5)	J-38 (2/4)	J-51 (2/6)	J-80 (1/3)
J-5 (3/5)	J-19 (2/4)	J-26 (2/5)	J-32 (3/5)	J-38 (4/2)	J-52 (2/6)	J-80 (3/1)
J-5 (5/3)	J-19 (4/2)	J-26 (4/2)	J-32 (5/3)	J-40 (3/5)	J-69 (1/3)	J-81 (3/5)
J-6 (2/4)	J-20 (2/4)	J-26 (5/2)	J-32 (5/2)	J-40 (5/3)	J-69 (1/4)	J-81 (5/3)
J-6 (3/5)	J-20 (2/5)	J-26 (4/1)	J-32 (4/2)	J-41 (1/3)	J-70 (1/3)	J-82 (3/5)
J-6 (2/5)	J-20 (2/6)	J-27 (2/4)	J-33 (2/4)	J-41 (1/4)	J-71 (2/4)	J-82 (3/6)
J-6 (4/2)	J-20 (3/5)	J-27 (2/5)	J-33 (2/5)	J-44 (1/3)	J-71 (4/2)	J-82 (5/3)
J-6 (5/2)	J-20 (4/2)	J-27 (3/5)	J-33 (3/5)	J-44 (2/4)	J-72 (2/4)	J-82 (6/3)
J-6 (4/2)	J-20 (5/2)	J-27 (4/2)	J-33 (5/3)	J-44 (2/5)	J-72 (4/2)	
J-6 (5/3)	J-21 (3/5)	J-27 (5/2)	J-33 (5/2)	J-44 (2/6)	J-73 (2/4)	

表 10

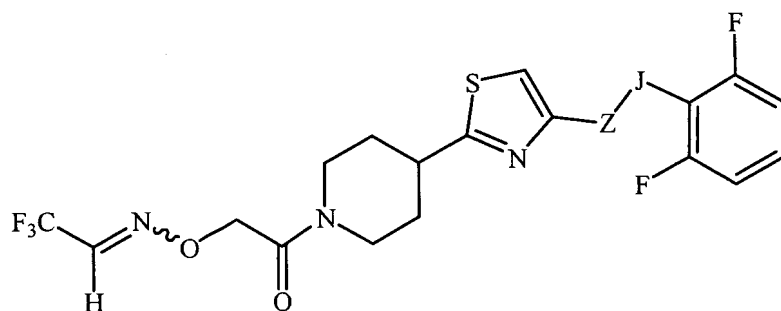


在表 10 中，J (如 J-3) 的結構在上面實施例中的示例 3 中示出。J 後面括號中的其他數字指 J 至噻唑環和如上結構 Z² 的連接點。第一個數字為 J 上噻唑環連接的環位置，第二個數字為 J 上與 Z² 連接的環位置。下列 (R⁶)_x 列指出不是上述結構中 -Z²-2,6-二氟苯取代基的 R⁶ 取代基。

Z² 列中的短劃線「-」指示一直接鍵。

J	(R ⁶) _x	Z ²	J	(R ⁶) _x	Z ²	J	(R ⁶) _x	Z ²
J-3 (2/4)	1-Me	-	J-74 (2/4)	3-CH ₃	-	J-69 (1/3)	4-CF ₃ O	-
J-3 (2/5)	1-Me	-	J-74 (2/5)	3-CH ₃	-	J-69 (1/3)	4-MeS	-
J-3 (4/2)	1-Me	-	J-74 (4/2)	3-CH ₃	-	J-69 (1/3)	4-MeS(=O)	-
J-3 (5/2)	1-Me	-	J-74 (5/2)	3-CH ₃	-	J-69 (1/3)	4-MeS(=O) ₂	-
J-9 (5/3)	1-Me	-	J-75 (3/5)	2-CH ₃	-	J-69 (1/3)	4-CF ₃ S	-
J-9 (3/5)	1-Me	-	J-75 (5/3)	2-CH ₃	-	J-69 (1/3)	4-CHF ₂ OCH ₂	-
J-12 (3/5)	1-Me	-	J-69 (1/3)	4-F	-	J-69 (1/3)	4-CH ₂ OH	-
J-12 (5/3)	1-Me	-	J-69 (1/3)	4-Cl	-	J-74 (2/5)	3-CH ₃ C(=O)	-
J-14 (3/5)	1-Me	-	J-69 (1/3)	4-OH	-	J-69 (1/3)	4-CH ₃ C(=O)O	-
J-39 (3/5)	4-Me	-	J-69 (1/3)	4-NH ₂	-	J-69 (1/3)	4-CH ₃ C(=O)S	-
J-39 (5/3)	4-Me	-	J-69 (1/3)	4-OEt	-	J-69 (1/3)	4-MeNHC(=O)	-
J-69 (1/3)	4-CN	O	J-69 (1/3)	4-NO ₂	NH	J-69 (1/3)	4-CF ₃	S
J-69 (1/3)	H	O	J-69 (1/3)	H	S	J-69 (1/3)	H	S(=O)
J-69 (1/3)	H	NH	J-69 (1/3)	H	NMe	J-69 (1/3)	H	S(=O) ₂
J-69 (1/3)	H	CH ₂						

表 11

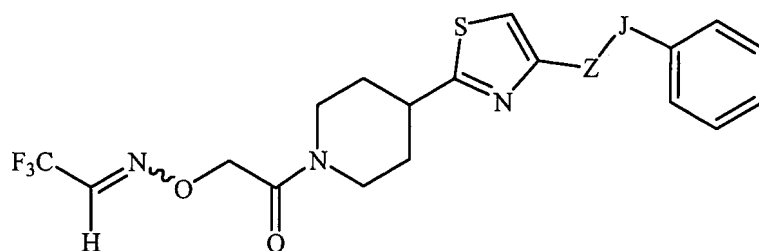


在表 11 中，J (如 J-3) 的結構在上面實施例中的
 示例 3 中示出，其中 x 為 1 且 R⁶ 為如上結構所述的 2,6-
 二氟苯基。J 後面括號中的數字指在上述結構中 J 至 Z
 和 2,6-二氟苯基環的連接點。第一個數字為 J 上與 Z 連
 5 接的環位置，第二個數字為 J 上與 2,6-二氟苯基環連接
 的環位置。

Z	J	Z	J	Z	J
CH ₂	J-3 (1/4)	CH ₂	J-18 (2/5)	CH ₂	J-31 (1/4)
CH ₂	J-6 (1/3)	CH ₂	J-26 (1/4)	CH ₂	J-35 (1/4)
CH ₂	J-9 (1/4)	CH ₂	J-30 (1/3)	CH ₂	J-36 (1/3)
CH ₂	J-12 (1/3)	CH ₂	J-30 (1/4)	CH ₂	J-42 (1/3)
CH ₂	J-17 (2/4)	CH ₂	J-31 (1/3)	CH ₂	J-42 (1/4)

10

表 12



15

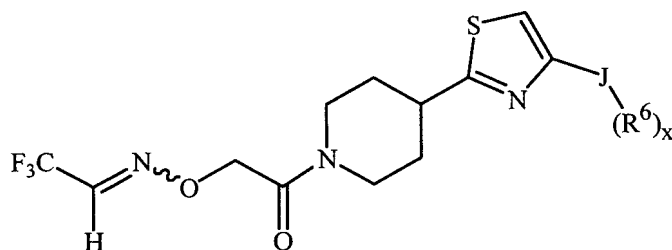
在表 12 中，J (如 J-29) 的結構在上面實施例中的
 「示例 3」中示出，其中 x 為 1 且 R⁶ 為如上結構所述的
 的苯基。J 後面括號中的數字指上述結構中 J 至 Z 和苯

環的连接點。第一個數字為 J 上與 Z 連接的環位置，第二個數字為 J 上與苯環連接的環位置。

Z	J	Z	J	Z	J
O	J-29 (3/5)	S(=O) ₂	J-29 (3/5)	N(<i>n</i> -Pr)	J-29 (3/5)
S	J-29 (3/5)	NH	J-29 (3/5)	CH ₂	J-29 (3/5)
S(=O)	J-29 (3/5)	N(Me)	J-29 (3/5)	CH(<i>i</i> -Bu)	J-29 (3/5)

5

表 13



10

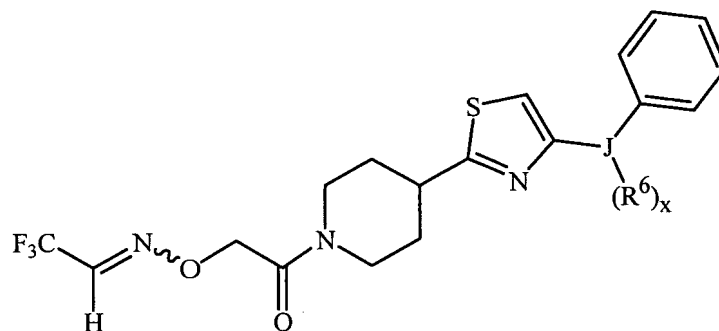
在表 13 中，J (如 J-53) 的結構在上面實施例中的示例 3 中示出。下列(R⁶)_x 列指出連接至 J 環的 R⁶ 取代基。當 R⁶ 為氫時，此即等同於 J 為未取代 (即 x 為 0)。J 後面括號中的數字指 J 環至上述結構中的噻唑環的连接點。

J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x
J-53 (2)	H	J-29 (3)	5-(4-Me-3-戊烯-1-基)	J-69 (1)	3- <i>c</i> -Pr
J-54 (2)	H	J-29 (3)	5-(3,3-di-Me-1-丁炔-1 基)	J-69 (1)	3- <i>c</i> -Bu
J-55 (2)	H	J-29 (3)	5-(4-Me- <i>c</i> -己基)	J-69 (1)	3- <i>c</i> -戊基
J-56 (2)	H	J-29 (3)	5-CF ₂ CF ₃	J-69 (1)	3- <i>c</i> -己基

J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x
J-57 (2)	1-Me	J-29 (3)	5-(3,3-di-Cl-2-丙烯-1-基)	J-69 (1)	3-CF ₃ O
J-58 (3)	1-Me	J-29 (3)	5-Me ₃ Si	J-69 (1)	3- <i>i</i> -PrO
J-59 (2)	H	J-69 (1)	4-CF ₃ CH ₂ S(=O) ₂	J-69 (1)	3- <i>i</i> -BuO
J-60 (2)	H	J-22 (2)	4- <i>i</i> -BuNH	J-69 (1)	3-Cl
J-61 (2)	H	J-22 (2)	4-(Et) ₂ N	J-69 (1)	3-Br
J-62 (2)	H	J-22 (2)	4- <i>c</i> -hexyl-NH	J-69 (1)	4-I
J-63 (3)	H	J-69 (1)	4-- <i>i</i> -PrOCH ₂	J-69 (1)	4-Me
J-64 (2)	H	J-69 (1)	4- <i>i</i> -PrC(=O) ₂	J-69 (1)	4-Et
J-65 (3)	H	J-29 (3)	5-CH ₃ C(=O)N H	J-69 (1)	4- <i>n</i> -Pr
J-66 (6)	H	J-29 (3)	5-(MeC(=O) ₂ N	J-69 (1)	4- <i>i</i> -Pr
J-53 (2)	H	J-29 (3)	5-PhC(=O)(Me) N	J-69 (1)	4- <i>n</i> -Bu
J-53 (2)	H	J-29 (3)	5-CH ₃ C(=O)(Et) N	J-69 (1)	4- <i>t</i> -Bu
J-67 (2)	H	J-29 (3)	5-PhC(=O)(Et) N	J-69 (1)	4-CH ₃ (CH ₂) ₄
J-68 (2)	H	J-29 (3)	5-MeOC(=O)N H	J-69 (1)	4-(Me) ₂ CH(CH ₂) ₂
J-53 (2)	H	J-29 (3)	5-EtOC(=O)NH	J-69 (1)	4-(Me) ₂ C(Et)
J-53 (2)	H	J-29 (3)	5-EtOC(=O)(M e)N	J-69 (1)	4- <i>c</i> -Pr
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3-Cl	J-69 (1)	4- <i>c</i> -Bu
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3-Br	J-69 (1)	4- <i>c</i> -戊基
J-68 (2)	H	J-69 (1)	3-I	J-69 (1)	4- <i>c</i> -己基
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3-Me	J-69 (1)	4-CF ₃ O
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3-Et	J-69 (1)	4-- <i>i</i> -PrO
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3- <i>n</i> -Pr	J-69 (1)	4- <i>i</i> -BuO
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3- <i>i</i> -Pr	J-69 (1)	3,4-di-Cl
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3-Bu	J-69 (1)	3,4-di-Br

J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3- <i>i</i> -Bu	J-69 (1)	3,4-di-Me
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3- <i>s</i> -Bu	J-69 (1)	3,4-di-Et
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3- <i>t</i> -Bu	J-69 (1)	3,4-di-MeO
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3-CH ₃ (CH ₂) ₄	J-69 (1)	3,4-di-EtO
J-69 (1)	4- <i>t</i> -BuS(=O) ₂	J-69 (1)	3-(Me) ₂ CH(CH 2) ₂	J-4 (2)	5- <i>i</i> -Bu
J-69 (1)	4-Et ₂ NC(=O)	J-69 (1)	3-(Me) ₂ C(Et)	J-5 (2)	5- <i>i</i> -Bu

表 14



5

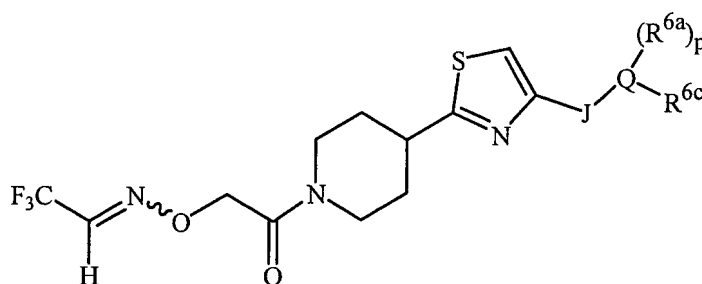
在表 14 中，J (如 J-29) 的結構在上面實施例中的示例 3 中示出。J 後面括號中的數字指上述結構中 J 與噻唑環和 2,6-二氟苯基的連接點。第一個數字為 J 上與噻唑環連接的環位置，第二個數字為 J 上與 2,6-二氟苯基連接的環位置。下列 (R⁶)_x 列指出連接至 J 環且非上述結構中的苯基的 R⁶ 取代基。

10

J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x
---	--------------------------------	---	--------------------------------	---	--------------------------------

J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x
J-29 (3/5)	4-Me	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	J-29 (3/5)	5-CF ₃
J-29 (3/5)	5-Me	J-29 (3/5)	5-Et	J-29 (3/5)	5-MeO
J-29 (3/5)	4,5-di-Me	J-29 (3/5)	5- <i>c</i> -Pr	J-26 (2/5)	1-Me

表 15



5

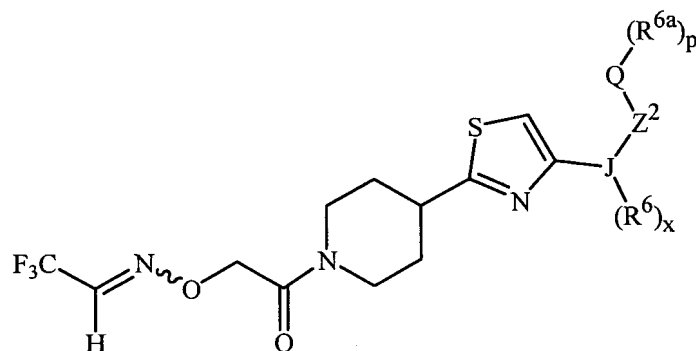
在表 15 中，J (如 J-29) 的結構在上面實施例中的示例 3 中示出其中 x 為 1、 R^6 為 $-Z^2Q$ 且 Z^2 為直接鍵。J 後面括號中的數字指 J 環與噻唑環和 Q 的連接點。第一個數字為 J 上與噻唑環連接的環位置，第二個數字為 J 上與 Q 連接的環位置。Q 的結構 (如 Q-3) 在上面實施例中的示例 5 中示出其中 g 為 0。下列 $(R^{6a})_p$ 與 R^{6c} 列指出連接至 Q 的取代基。下列 $(R^{6a})_p$ 列中的折號「-」指出未有 R^{6a} 取代基存在。

10

J	Q	(R ^{6a}) _p	R ^{6c}	J	Q	(R ^{6a}) _p	R ^{6c}
J-29 (3/5)	Q-3	-	Me	J-29 (3/5)	Q-88	-	Me
J-29 (3/5)	Q-10	-	Me	J-29 (3/5)	Q-92	-	Me
J-29 (3/5)	Q-11	-	Me	J-29 (3/5)	Q-95	-	Me
J-29 (3/5)	Q-12	-	Me	J-29 (3/5)	Q-102	-	Me
J-29 (3/5)	Q-13	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	-	MeC(=O)
J-29 (3/5)	Q-14	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	-	MeOC(=O)
J-29 (3/5)	Q-21	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	-	MeO
J-29 (3/5)	Q-22	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	5-Cl	Me
J-29 (3/5)	Q-23	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	5-Me	Me

J	Q	(R ^{6a}) _p	R ^{6c}	J	Q	(R ^{6a}) _p	R ^{6c}
J-29 (3/5)	Q-28	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	5-NO ₂	Me
J-29 (3/5)	Q-31	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	5-NH ₂	Me
J-29 (3/5)	Q-72	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	6-Cl	Me
J-29 (3/5)	Q-75	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	6-Me	Me
J-29 (3/5)	Q-78	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	6-NO ₂	Me
J-29 (3/5)	Q-79	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	6-NH ₂	Me
J-29 (3/5)	Q-86	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	5,6-di-Cl	Me

表 16



5

10

15

在表 16 中，J (如 J-69) 的結構在上面實施例中的示例 3 中示出。J 後面括號中的數字指上述結構中 J 環與噻唑環和 Z² 的連接點。第一個數字為 J 上與噻唑環連接的環位置，第二個數字為 J 上與 Z² 連接的環位置。下列 (R⁶)_x 列指出連接至 J 環且非上述結構中 -Z²Q 取代基的取代基。下列 Z² 列中的折號「-」指出直接鍵。Q (如 Q-1) 的結構在上面實施例中的示例 5 中示出其中 g 為 0 而 R^{6c} 取代基為氫。下列 (R^{6a})_p 列指出連接至 Q 環的取代基。

J	Z ²	R ⁶	(R ^{6a}) _p	Q	J	Z ²	R ⁶	(R ^{6a}) _p	Q
J-69 (1/4)	O	H	H	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	3- MeS(=O) ₂	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-1	J-29 (3/5)	-	H	3-MeNH	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-2	J-29 (3/5)	-	H	4-(Me) ₂ N	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-4	J-29 (3/5)	-	H	2-MeOCH ₂	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-5	J-29 (3/5)	-	H	3- MeC(O) ₂	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-6	J-29 (3/5)	-	H	3-MeNHC(O)	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-7	J-29(3/5)	-	H	4-MeOC(O)O	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-8	J-29 (3/5)	-	H	4-MeC(O)S	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-9	J-29 (3/5)	-	H	3-(Me) ₂ NC(O)	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-15	J-29 (3/5)	-	H	4-Me ₃ Si	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-16	J-29 (3/5)	-	H	2,6-di-Et	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-17	J-29 (3/5)	-	H	2,6-di-Cl	Q-45
J-29(3/5)	-	H	H	Q-18	J-29 (3/5)	-	H	2-OH	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-19	J-29 (3/5)	-	H	4-CHF ₂ O	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-20	J-26 (2/5)	-	-	-CH ₂ CH ₂ - [Note 1]	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-24	J-26 (3/5)	-	-	1-Me, -CH ₂ CH ₂ - [附註 1]	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-25	J-26 (2/5)	CH ₂	H	4-OH	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-26	J-26 (2/5)	CH ₂	H	4-MeO	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-27	J-26 (2/4)	CH ₂	H	4-OH	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-29	J-26 (2/4)	CH ₂	H	4-MeO	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-30	J-25 (2/4)	CH ₂	H	4-OH	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-32	J-25 (2/4)	CH ₂	H	4-MeO	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-33	J-1 (2/4)	-	5-Me	2,6-di-F	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-34	J-3 (2/5)	-	-	-CH ₂ CH ₂ - [附註 2]	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-35	J-29 (3/5)	NH ₂	H	2,6-di-F	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-36	J-29 (3/5)	NMe	H	2,6-di-F	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-36	J-29 (3/5)	NEt	H	2,6-di-F	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-37	J-29 (3/5)	<i>Nn</i> -Pr	H	2,6-di-F	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-38	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-39	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-40	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-73
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-41	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-74
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-42	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-76
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-43	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-77
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-44	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-80
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-46	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-81
J-29 (3/5)	CH ₂	H	H	Q-47	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-82

J	Z ²	R ⁶	(R ^{6a}) _p	Q	J	Z ²	R ⁶	(R ^{6a}) _p	Q
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-48	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-83
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-49	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-84
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-50	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-85
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-51	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-89
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-52	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-90
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-53	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-91
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-54	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-93
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-55	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-94
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-56	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-96
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-57	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-97
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-58	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-98
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-59	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-99
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-60	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-100
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-61	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-101
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-61	J-29 (3/5)	-	H	4-Cl	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-61	J-29 (3/5)	-	H	5-Cl	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-62	J-29 (3/5)	-	H	6-Cl	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-63	J-29 (3/5)	-	H	7-Cl	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-64	J-29 (3/5)	-	H	4-Me	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-65	J-29 (3/5)	-	H	5-Me	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-66	J-29 (3/5)	-	H	6-Me	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-67	J-29 (3/5)	-	H	5-CF ₃	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-68	J-29 (3/5)	-	H	5-NO ₂	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-69	J-29 (3/5)	-	H	6-Br	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	2-Me	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	6-NO ₂	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	3-Me	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	6-NH ₂	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	4-Me	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	6-MeO	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	2-Cl	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5,6-di-MeO	Q-71
J-2 9(3/5)	-	H	3-Cl	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5,6-di-Cl	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	4-Cl	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-Cl	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	2-MeO	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-Me	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	3-MeO	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-NO ₂	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	4-MeO	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-NH ₂	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	2-Et	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	6-Cl	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	3- <i>i</i> -Pr	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	6-Me	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	2,6-di-Me	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	6-NO ₂	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	4-CH ₂ =CH	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	6-NH ₂	Q-70
J-29(3/5)	-	H	4-CH≡C	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5,6-di-Cl	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	4- <i>c</i> -Pr	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-Cl,6-OH	Q-70

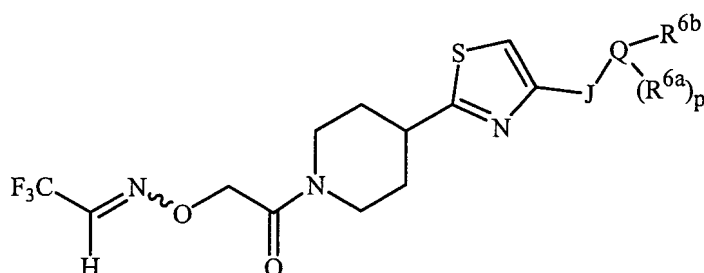
J	Z ²	R ⁶	(R ^{6a}) _p	Q	J	Z ²	R ⁶	(R ^{6a}) _p	Q
J-29 (3/5)	-	H	3-CF ₃	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	4-Me	Q-63
J-29 (3/5)	-	H	3-CF ₃ O	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	4-NO ₂	Q-63
J-29 (3/5)	-	H	4-Br	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	4-NH ₂	Q-63
J-29 (3/5)	-	H	3-OH	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-Cl	Q-63
J-29 (3/5)	-	H	3-NH ₂	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-Me	Q-63
J-29 (3/5)	-	H	2-CN	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-CN	Q-63
J-29 (3/5)	-	H	4- <i>t</i> -BuO	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-NO ₂	Q-63
J-29(3/5)	-	H	4-MeS	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-NH ₂	Q-63
J-29 (3/5)	-	H	4-CF ₃ S	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-MeCO ₂	Q-63
					J-29 (3/5)	-	H	5,6-di-Cl	Q-63

[附註 1]: 由在 J-26 的 4 位置的 R⁶ 與在 Q-45 的 2 位置的 R^{6a} 一起形成。

[附註 2]: 由在 J-3 的 1 位置的 R⁶ 與在 Q-45 的 2 位置的 R^{6a} 一起形成。

5

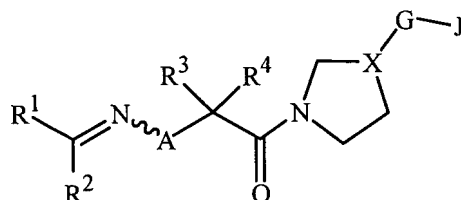
表 17



在表 17 中，J (如 J-29) 的結構在上面實施例中的
 示例 3 中示出其中 x 為 1、R⁶ 為 Q 且 Z² 為直接鍵。J
 後面括號中的數字指 J 環與噻唑環和 Q 的連接點。第一
 個數字為 J 上與噻唑環連接的環位置，第二個數字為 J
 上與 Q 連接的環位置。Q 的結構 (如 Q-87) 在上面實
 施例中的示例 5 中示出其中 g 為 1。下列 (R^{6a})_p 與 R^{6b}
 列出指出連接至 Q 的取代基。

J	Q	(R ^{6a}) _p	R ^{6b}
J-29 (3/5)	Q-87		4-Ph
J-29 (3/5)	Q-45	6-F	2-Ph
J-29 (3/5)	Q-45		2-(1 <i>H</i> -咪唑-2-基)
J-29 (3/5)	Q-45		2-(1 <i>H</i> -吡唑-1-基)
J-29 (3/5)	Q-45		2-(1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基)
J-29 (3/5)	Q-45		2-(1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基)

表 18



5

在表 18 中，G -1 與 G-2 的結構在上面實施例中的
 示例 2 中示出，其中在上述結構中向左伸出的鍵連接至
 X，向右伸出的鍵連接至 J。在示例 2 中示出的連接至 G
 的 R^{26a} 取代基為 H。

10

J 為 C(=W²)NT^AT^B 且 W² 為 O。

R ¹	R ²	A	X	G	NT ^A T ^B
----------------	----------------	---	---	---	--------------------------------

CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-苯基丙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	<i>N</i> -甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	<i>N</i> ,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	<i>N</i> ,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	<i>N</i> -甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	<i>N</i> ,2-二甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	<i>N</i> ,2,2-三甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	<i>N</i> -甲基-3-羥基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	<i>N</i> -甲基-3-側氧-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> H-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2-氰基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-苯基丙基胺基

J 為 C(=W²)NT^AT^B 且 W² 為 O。

R ¹	R ²	A	X	G	NT ^A T ^B
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氰基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯乙基胺基

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R ¹	R ²	A	X	G	NT ^A T ^B
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基丙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基

J 為 C(=W²)NT^AT^B 且 W² 為 O。

R ¹	R ²	A	X	G	NT ^A T ^B
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯丙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氰基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R^1	R^2	A	X	G	$NT^A T^B$
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯丙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茚基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基

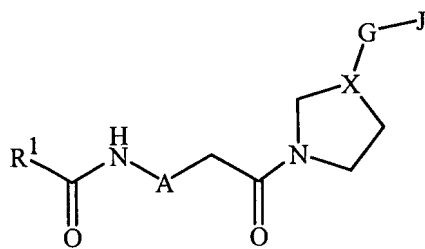
J 為 C(=W²)NT^AT^B 且 W² 為 O。

R ¹	R ²	A	X	G	NT ^A T ^B
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基丙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氰基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R^1	R^2	A	X	G	$NT^A T^B$
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-O-	X ²	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ²	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ²	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-O-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	O-	X ²	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ²	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ²	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基

表 19



在表 19 中，G -1 與 G-2 的結構在上面實施例中的
 示例 2 中示出，其中在上述結構中向左伸出的鍵連接至
 X，向右伸出的鍵連接至 J。在示例 2 中示出的連接至 G
 的 R26a 取代基為 H。

J 為 C(=W²)NT^AT^B 且 W² 為 O。

R ¹	A	X	G	NT ^A T ^B
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基丙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茛菪基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茛菪基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茛菪基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茛菪基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茛菪基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R^1	A	X	G	$NT^A T^B$
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟基苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基丙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基

J 為 C(=W²)NT^AT^B 且 W² 為 O。

R ¹	A	X	G	NT ^A T ^B
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茛基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氰基苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R^1	A	X	G	$NT^A T^B$
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基丙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茛基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基

J 為 C(=W²)NT^AT^B 且 W² 為 O。

R ¹	A	X	G	NT ^A T ^B
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>NH</i> -1-苯乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2-氰基苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-苯乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1-苯丙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1 <i>R</i>)- <i>N</i> -甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	<i>N</i> -甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	<i>N</i> ,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基

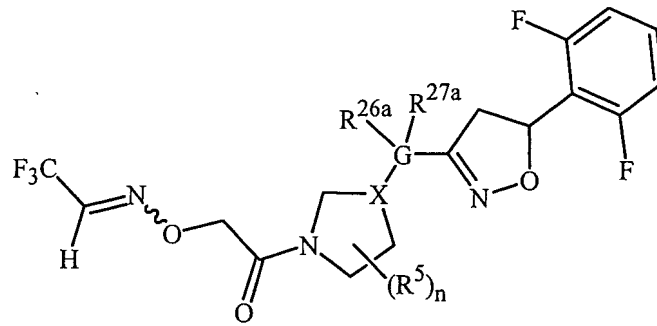
J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R^1	A	X	G	$NT^A T^B$
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茚基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茚基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茚基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茚基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茚基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氰基苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基

J 為 C(=W²)NT^AT^B 且 W² 為 O。

R ¹	A	X	G	NT ^A T ^B
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-NH-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O-	X ²	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-NH-	X ²	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ²	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基

表 20



在表 20 中，G (如 G-1) 的結構在上面實施例中的示例 2 中示出，其中在上述結構中向左伸出的鍵連接至 X，向右伸出的鍵連接至異噁唑環。下列 $(R^5)_n$ 列中的短劃線「-」指出 R^5 取代基在含有 X 的環的位置並相對於在該環上的氮原子。下列 R^{27a} 列中的短劃線「-」指出 R^{27a} 存在於示例 2 中示出的 G 環。

X	$(R^5)_n$	G	R^{26a}	R^{27a}
X ¹	-	G-1	H	-
X ¹	-	G-2	H	-
X ¹	-	G-3	H	H
X ¹	-	G-4	H	-
X ¹	-	G-5	H	-
X ¹	-	G-6	H	H
X ¹	-	G-7	H	-
X ¹	-	G-8	H	-
X ¹	-	G-9	H	H
X ¹	-	G-10	H	-
X ¹	-	G-11	H	-
X ¹	-	G-12	H	H
X ¹	-	G-13	H	H
X ¹	-	G-14	H	-
X ¹	-	G-15	H	-
X ¹	-	G-16	H	H
X ¹	-	G-17	H	-
X ¹	-	G-18	H	-
X ¹	-	G-19	H	H
X ¹	-	G-20	H	-
X ¹	-	G-21	H	-

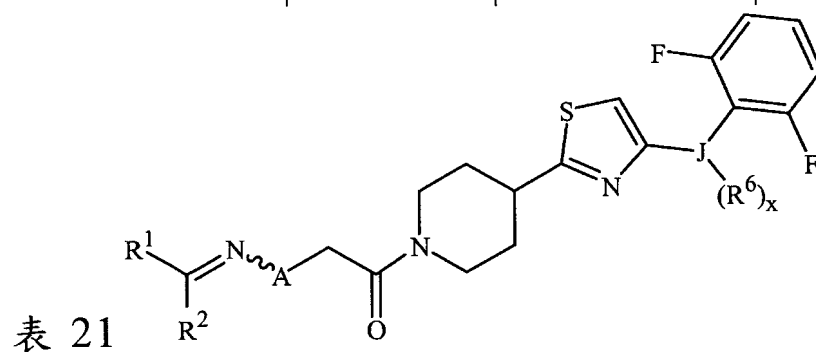
X	(R ⁵) _n	G	R ^{26a}	R ^{27a}
X ¹	-	G-22	H	H
X ¹	-	G-23	H	-
X ¹	-	G-24	H	-
X ¹	-	G-25	H	-
X ¹	-	G-26	H	-
X ¹	-	G-27	H	-
X ¹	-	G-28	H	-
X ¹	-	G-29	H	-
X ¹	-	G-30	H	-
X ¹	-	G-31	H	-
X ¹	-	G-32	H	-
X ¹	-	G-33	H	-
X ¹	-	G-34	H	-
X ¹	-	G-35	H	-
X ¹	-	G-36	H	-
X ¹	-	G-37	H	-
X ¹	-	G-38	H	-
X ¹	-	G-39	H	H
X ¹	-	G-40	H	-
X ¹	-	G-41	H	-
X ¹	-	G-42	H	H
X ¹	-	G-43	H	H
X ¹	-	G-44	H	-
X ¹	-	G-45	H	-
X ¹	-	G-46	H	-
X ¹	-	G-47	H	-
X ¹	-	G-48	H	H
X ¹	-	G-49	H	-
X ¹	-	G-50	H	-
X ¹	-	G-51	H	H
X ¹	-	G-52	H	-
X ¹	-	G-53	H	-
X ¹	-	G-54	H	H
X ¹	-	G-55	H	-
X ¹	-	G-56	H	-
X ¹	-	G-57	H	-
X ¹	-	G-58	H	H
X ¹	-	G-59	H	H
X ¹	-	G-2	Me	-

X	(R ⁵) _n	G	R ^{26a}	R ^{27a}
X ¹	-	G-2	Cl	-
X ¹	-	G-2	F	-
X ¹	-	G-2	CF ₃	-
X ¹	-	G-14	<i>n</i> -Pr	-
X ¹	-	G-3	H	Me
X ¹	-	G-3	H	<i>n</i> -Pr
X ¹	-	G-26	5-Me	-
X ¹	2-Me	G-1	H	-
X ¹	3-Me	G-1	H	-
X ¹	2,6-di-Me	G-1	H	-
X ¹	3,5-di-Me	G-1	H	-
X ¹	3- <i>n</i> -Bu	G-1	H	-
X ¹	4-MeO	G-1	H	-
X ¹	4-OH	G-1	H	-
X ¹	4-Cl	G-1	H	-
X ¹	4-Br	G-1	H	-
X ¹	4-CN	G-1	H	-
X ²	-	G-1	H	-
X ²	-	G-2	H	-
X ²	-	G-3	H	H
X ²	-	G-4	H	-
X ²	-	G-5	H	-
X ²	-	G-6	H	H
X ²	-	G-7	H	-
X ²	-	G-8	H	-
X ²	-	G-9	H	H
X ²	-	G-10	H	-
X ²	-	G-11	H	-
X ²	-	G-12	H	H
X ²	-	G-13	H	H
X ²	-	G-14	H	-
X ²	-	G-15	H	-
X ²	-	G-16	H	H
X ²	-	G-17	H	-
X ²	-	G-18	H	-
X ²	-	G-19	H	H
X ²	-	G-20	H	-
X ²	-	G-21	H	-
X ²	-	G-22	H	H

X	(R ⁵) _n	G	R ^{26a}	R ^{27a}
X ²	-	G-23	H	-
X ²	-	G-24	H	-
X ²	-	G-31	H	-
X ²	-	G-32	H	-
X ²	-	G-33	H	-
X ²	-	G-34	H	-
X ²	-	G-35	H	-
X ²	-	G-37	H	-
X ²	-	G-38	H	-
X ²	-	G-39	H	H
X ²	-	G-40	H	-
X ²	-	G-41	H	-
X ²	-	G-42	H	H
X ²	-	G-43	H	H
X ²	-	G-44	H	-
X ²	-	G-45	H	-
X ²	-	G-46	H	-
X ²	-	G-47	H	-
X ²	-	G-48	H	H
X ²	-	G-49	H	-
X ²	-	G-50	H	-
X ²	-	G-51	H	H
X ²	-	G-52	H	-
X ²	-	G-53	H	-
X ²	-	G-54	H	H
X ²	-	G-2	Me	-
X ²	-	G-2	Cl	-
X ²	-	G-2	F	-
X ²	-	G-2	CF ₃	-
X ²	-	G-14	<i>n</i> -Pr	-
X ²	-	G-3	H	Me
X ²	-	G-3	H	<i>n</i> -Pr
X ²	2-Me	G-1	H	-
X ²	3-Me	G-1	H	-
X ²	2,6-di-Me	G-1	H	-
X ²	3,5-di-Me	G-1	H	-
X ²	3- <i>n</i> -Bu	G-1	H	-
X ³	-	G-1	H	-
X ³	-	G-2	H	-

X	$(R^5)_n$	G	R ^{26a}	R ^{27a}
X ³	-	G-3	H	H
X ³	-	G-4	H	-
X ³	-	G-5	H	-
X ³	-	G-6	H	H
X ³	-	G-7	H	-
X ³	-	G-8	H	-
X ³	-	G-9	H	H
X ³	-	G-10	H	-
X ³	-	G-11	H	-
X ³	-	G-12	H	H
X ³	-	G-13	H	H
X ³	-	G-14	H	-
X ³	-	G-15	H	-
X ³	-	G-16	H	H
X ³	-	G-17	H	-
X ³	-	G-18	H	-
X ³	-	G-19	H	H
X ³	-	G-20	H	-
X ³	-	G-21	H	-
X ³	-	G-22	H	H
X ³	-	G-23	H	-
X ³	-	G-24	H	-
X ³	-	G-31	H	-
X ³	-	G-32	H	-
X ³	-	G-33	H	-
X ³	-	G-34	H	-
X ³	-	G-35	H	-
X ³	-	G-37	H	-
X ³	-	G-38	H	-
X ³	-	G-39	H	H
X ³	-	G-40	H	-
X ³	-	G-41	H	-
X ³	-	G-42	H	H
X ³	-	G-43	H	H
X ³	-	G-44	H	-
X ³	-	G-45	H	-
X ³	-	G-46	H	-
X ³	-	G-47	H	-
X ³	-	G-48	H	H

X	(R ⁵) _n	G	R ^{26a}	R ^{27a}
X ³	-	G-49	H	-
X ³	-	G-50	H	-
X ³	-	G-51	H	H
X ³	-	G-52	H	-
X ³	-	G-53	H	-
X ³	-	G-54	H	H
X ³	-	G-2	Me	-
X ³	-	G-2	Cl	-
X ³	-	G-2	F	-
X ³	-	G-2	CF ₃	-
X ³	-	G-14	<i>n</i> -Pr	-
X ³	-	G-3	H	Me
X ³	-	G-3	H	<i>n</i> -Pr
X ³	2-Me	G-1	H	-
X ³	3-Me	G-1	H	-
X ³	2,6-di-Me	G-1	H	-
X ³	3,5-di-Me	G-1	H	-
X ³	3- <i>n</i> -Bu	G-1	H	-
X ³	5-Me	G-1	H	-
X ³	6-Me	G-1	H	-
X ⁴	-	G-1	H	-
X ⁵	-	G-1	H	-
X ⁶	-	G-1	H	-
X ⁷	-	G-1	H	-
X ⁸	-	G-1	H	-
X ⁹	-	G-1	H	-



在表 21 中，J (如 J-1) 的結構在上面實施例中的示例 3 中示出。J 後面括號中的數字指上述結構中 J 環與噻唑環和 2,6-二氟苯基環的連接點。第一個數字為 J

上與噻唑環連接的環位置，第二個數字為 J 上與 2,6-二氟苯基環連接的環位置。下列(R⁶)_x 列指出非為上述結構中的 2,6-二氟苯基的 R⁶ 取代基。

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	H	-O-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	Me	-O-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	H	-NH-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-1 (2/4)	H
Me	Me	-O-	J-1 (2/4)	H
Me	Me	-NH-	J-1 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-1 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	H	-O-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	Me	-O-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	H	-NH-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-2 (2/4)	H
Me	Me	-O-	J-2 (2/4)	H
Me	Me	-NH-	J-2 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-2 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	H	-O-	J-3 (2/4)	1-Me
CF ₃	Me	-O-	J-3 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-NH-	J-3 (2/4)	1-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-3 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-3 (2/4)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-3 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-3 (2/4)	1-Me

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-3 (2/4)	1-Me
Me	Me	-O-	J-3 (2/4)	1-Me
Me	Me	-NH-	J-3 (2/4)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-3 (2/4)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-3 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-O-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-4 (2/5)	H
Me	Me	-O-	J-4 (2/5)	H
Me	Me	-NH-	J-4 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-4 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	Me	-O-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	H	-NH-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-8 (5/3)	H
Me	Me	-O-	J-8 (5/3)	H
Me	Me	-NH-	J-8 (5/3)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-8 (5/3)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	H	-O-	J-9 (5/3)	H
CF ₃	Me	-O-	J-9 (5/3)	H
CF ₃	H	-NH-	J-9 (5/3)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-9 (5/3)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-9 (5/3)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-9 (5/3)	H

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-9 (5/3)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-9 (5/3)	H
Me	Me	-O-	J-9 (5/3)	H
Me	Me	-NH-	J-9 (5/3)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-9 (5/3)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-9 (5/3)	H
CF ₃	H	-O-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-11 (3/5)	H
Me	Me	-O-	J-11 (3/5)	H
Me	Me	-NH-	J-11 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-11 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-12 (3/5)	H
Me	Me	-O-	J-12 (3/5)	H
Me	Me	-NH-	J-12 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-12 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-12 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-O-	J-12 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-NH-	J-12 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-12 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-12 (3/5)	1-Me

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-12 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-12 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-12 (3/5)	1-Me
Me	Me	-O-	J-12 (3/5)	1-Me
Me	Me	-NH-	J-12 (3/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-12 (3/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-12 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-O-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-14 (3/5)	H
Me	Me	-O-	J-14 (3/5)	H
Me	Me	-NH-	J-14 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-14 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-15 (2/5)	H
Me	Me	-O-	J-15 (2/5)	H
Me	Me	-NH-	J-15 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-15 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-16 (2/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-16 (2/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-16 (2/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-16 (2/5)	H

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-16 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-16 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-16 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-16 (2/5)	H
Me	Me	-O-	J-16 (2/5)	H
Me	Me	-NH-	J-16 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-16 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-16 (2/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	Me	-O-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	H	-NH-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-22 (2/4)	H
Me	Me	-O-	J-22 (2/4)	H
Me	Me	-NH-	J-22 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-22 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	H	-O-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	Me	-O-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	H	-NH-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-24 (2/4)	H
Me	Me	-O-	J-24 (2/4)	H
Me	Me	-NH-	J-24 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-24 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	H	-O-	J-25 (2/4)	H
CF ₃	Me	-O-	J-25 (2/4)	H
CF ₃	H	-NH-	J-25 (2/4)	H

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	Me	-NH-	J-25 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-25 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-25 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-25 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-25 (2/4)	H
Me	Me	-O-	J-25 (2/4)	H
Me	Me	-NH-	J-25 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-25 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-25 (2/4)	H
CF ₃	H	-O-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	Me	-O-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	H	-NH-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/4)	H
Me	Me	-O-	J-26 (2/4)	H
Me	Me	-NH-	J-26 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-26 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	H	-O-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	Me	-O-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-NH-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/4)	1-Me
Me	Me	-O-	J-26 (2/4)	1-Me
Me	Me	-NH-	J-26 (2/4)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-26 (2/4)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-O-	J-26 (2/5)	1-Me
CF ₃	Me	-O-	J-26 (2/5)	1-Me

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	H	-NH-	J-26 (2/5)	1-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-26 (2/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-26 (2/5)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-26 (2/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/5)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/5)	1-Me
Me	Me	-O-	J-26 (2/5)	1-Me
Me	Me	-NH-	J-26 (2/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-26 (2/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/5)	1-Me
CF ₃	H	-O-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-28 (3/5)	H
Me	Me	-O-	J-28 (3/5)	H
Me	Me	-NH-	J-28 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-28 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-30 (3/5)	H
Me	Me	-O-	J-30 (3/5)	H
Me	Me	-NH-	J-30 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-30 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-30 (3/5)	1-Me

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	Me	-O-	J-30 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-NH-	J-30 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-30 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-30 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-30 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-30 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-30 (3/5)	1-Me
Me	Me	-O-	J-30 (3/5)	1-Me
Me	Me	-NH-	J-30 (3/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-30 (3/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-30 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-O-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-O-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-NH-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-36 (3/5)	1-Me
Me	Me	-O-	J-36 (3/5)	1-Me
Me	Me	-NH-	J-36 (3/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-36 (3/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-O-	J-37 (2/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-37 (2/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-37 (2/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-37 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-37 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-37 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-37 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-37 (2/5)	H
Me	Me	-O-	J-37 (2/5)	H
Me	Me	-NH-	J-37 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-37 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-37 (2/5)	H

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	H	-O-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-38 (2/5)	H
Me	Me	-O-	J-38 (2/5)	H
Me	Me	-NH-	J-38 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-38 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-39 (3/5)	H
Me	Me	-O-	J-39 (3/5)	H
Me	Me	-NH-	J-39 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-39 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-40 (3/5)	H
Me	Me	-O-	J-40 (3/5)	H
Me	Me	-NH-	J-40 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-40 (3/5)	H

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	Me	-O-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	H	-NH-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-69 (1/3)	H
Me	Me	-O-	J-69 (1/3)	H
Me	Me	-NH-	J-69 (1/3)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-69 (1/3)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	H	-O-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	Me	-O-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	H	-NH-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-69 (1/4)	H
Me	Me	-O-	J-69 (1/4)	H
Me	Me	-NH-	J-69 (1/4)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-69 (1/4)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	H	-O-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	Me	-O-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	H	-NH-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	5-Me
Me	Me	-O-	J-29 (3/5)	5-Me
Me	Me	-NH-	J-29 (3/5)	5-Me

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	5-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	H	-O-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	Me	-O-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	H	-NH-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	4-Me
Me	Me	-O-	J-29 (3/5)	4-Me
Me	Me	-NH-	J-29 (3/5)	4-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	4-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	H	-O-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
CF ₃	Me	-O-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
CF ₃	H	-NH-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
Me	Me	-O-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
Me	Me	-NH-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me

製劑/效用

本發明的式 1 化合物將通常作為殺真菌活性成分，與至少一種選自表面活性劑、固體稀釋劑和液體稀釋劑（作為載體）一起用於組合物（即製劑）中。還可
5 使用在排除式 1 的前提條件(a)的範圍內的化合物。對製

劑或組合物成分進行選擇以與活性成分的物理性質、施用模式和諸如土壤類型、濕度和溫度之類的环境因素相符合。

5 可用的製劑包括液體組合物和固體組合物兩者。液體組合物包括溶液劑（包括乳油）、懸浮劑、乳劑（包括微乳劑和/或懸乳劑）等，可任選將其增稠成凝膠劑。一般的水性液體組合物類型是可溶液劑、懸浮劑、微囊懸浮劑、濃乳劑、微乳劑和懸乳劑。一般的非水性液體組合物類型是乳油、微乳油、可分散液劑和油分散體。

10 一般的固體組合物類型是粉塵劑、粉劑、顆粒劑、球劑、丸劑、錠劑、片劑、填充膜劑（包括種子包衣）等，其可以是水分散性的（「可濕的」）或水溶性的。用成膜溶液或可流動混懸液形成的膜和包衣尤其可用於種子處理。活性成分可進行(微)膠囊包封並進一步形成懸浮劑或固體製劑；作為另一種選擇，可對整個活性成分的製劑進行包封（或「加護膜」）。封裝可控制或延緩活性成分的釋放。可乳化顆粒結合了乳油製劑和乾顆粒狀製劑兩者的優勢。高濃度組合物主要用作中間體，用於進一步配製。

20 在噴施前，可噴施的製劑通常在合適的介質中擴充。這種液體和固體製劑被配製成易於在這種噴霧介質（通常是水）中稀釋。噴霧劑體積可在每公頃 1 升至數千升的範圍內，但更通常是在每公頃約 10 至數百升的範圍內。可噴施的製劑可與水或另一種合適的介質在罐內混合，用於通過空中噴藥或地面噴藥對葉片進行處理，或用於給植物的生長培養基噴藥。可在種植期間，

將液體和乾製劑直接定量供應給滴灌系統或定量供應進壟溝中。可將液體和固體製劑施加至穀物或其他所欲植生的種子上作為種植前的種子處理，以保護髮育的根和其他地下植物部分和/或通過系統攝取而保護葉子。

- 5 該製劑將通常含有有效量的活性成分、稀釋劑和表面活性劑，處於下面配方表中的大概範圍內，這些成分的配方合計為 100 重量百分比。

	重量百分比		
	活性成分	稀釋劑	表面活性劑
水分散性和水溶性顆粒劑、片劑和粉劑	0.001-90	0-99.999	0-15
油分散體、懸浮劑、乳劑、溶液劑 (包括乳油)	1-50	40-99	0-50
粉塵劑	1-25	70-99	0-5
顆粒劑和球劑	0.001-95	5-99.999	0-15
高濃度組合物	90-99	0-10	0-2

0 固體稀釋劑包括(例如):黏土類如膨潤土、蒙脫石、綠坡縷石和高嶺土;石膏;纖維素;二氧化鈦;氧化鋅;澱粉;糊精;糖類(如乳糖、蔗糖);二氧化矽;滑石;雲母;矽藻土;尿素;碳酸鈣;碳酸鈉和碳酸氫鈉;以及硫酸鈉。代表性的固體稀釋劑在 Watkins 等人, *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey 中有所描述。

15 液體稀釋劑包括(例如)水、*N,N*-二甲基烷醯胺(如 *N,N*-二甲基甲醯胺)、檸檬烯、二甲基亞砷、*N*-烷基吡

咯烷酮（如 *N*-甲基吡咯烷酮）、乙二醇、三甘醇、丙二
醇、雙丙甘醇、聚丙二醇、碳酸丙二酯、碳酸丁二酯、
石蠟（如石蠟油、正構烷烴、異鏈烷烴）、烷基苯、烷
基萘、甘油、甘油三醋酸酯、山梨醇、芳族烴、去芳脂
5 族化合物、烷基苯、烷基萘、酮類（例如環己酮、2-庚
酮、異佛樂酮和 4-羥基-4-甲基-2-戊酮）、醋酸酯類（例
如醋酸異戊酯、醋酸己酯、醋酸庚酯、醋酸辛酯、醋酸
壬酯、醋酸十三烷基酯和醋酸異冰片酯）、其他酯類（例
如烷基化乳酸酯、二元酯和 γ -丁內酯），以及醇類，其
10 可以是直鏈的、支鏈的、飽和的或不飽和的，例如甲醇、
乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、正己醇、2-
以及己醇、正辛醇、癸醇、異癸醇、異硬脂醇、鯨蠟醇、
月桂醇、十三醇、油醇、環己醇、四氫糠醇、二丙酮醇
和苜醇。液體稀釋劑還包括飽和和不飽和脂肪酸（通常
15 為 C_6 - C_{22} ）的甘油酯，例如植物種子和果實油（如橄欖、
蓖麻、亞麻籽、芝麻、玉米（玉蜀黍）、花生、向日葵、
葡萄籽、紅花、棉籽、大豆、油菜籽、椰子和棕櫚仁的
油）、動物源脂肪（如牛脂、豬脂、豬油、鱈魚肝油、
魚油）以及它們的混合物。液體稀釋劑還包括烷基化脂
20 肪酸（如甲基化、乙基化、丁基化脂肪酸），其中脂肪
酸可通過使植物和動物來源的甘油酯水解而獲得，並且
可通過蒸餾純化。代表性的液體稀釋劑在 Marsden,
Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950 中
有所描述。

25 本發明的固體和液體組合物通常包括一種或多種
表面活性劑。當添加至一液體時，表面活性劑（亦已知

為「界面活性劑」)一般可改變，最常為降低液體的表面張力。取決於表面活性劑分子中的親水或疏水基團本質，表面活性劑可作為濕潤劑、分散劑、乳化劑或去泡劑。

5 表面活性劑可分為非離子型、陰離子型或陽離子型。可用於本發明的非離子型表面活性劑包括，但不限於：醇烷氧基化物，例如基於天然醇和合成醇（其可以是支鏈或直鏈醇）並用醇和環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或它們的混合物製備的醇烷氧基化物；胺乙氧基化物、烷醇醯胺和乙氧基化烷醇醯胺；烷氧基化三甘油酯，例如乙氧基化的大豆油、蓖麻油和油菜籽油；烷基酚烷氧基化物，例如辛基酚乙氧基化物、壬基酚乙氧基化物、二壬基酚乙氧基化物和十二烷基酚乙氧基化物（用酚和環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或它們的混合物製備）；用環氧乙烷或環氧丙烷製備的嵌段聚合物和其中末端鏈段是用環氧丙烷製備的反向嵌段聚合物；乙氧基化脂肪酸；乙氧基化脂肪酯和乙氧基化油；乙氧基化甲基酯；乙氧基化三苯乙烯苯酚（包括用環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或它們的混合物製備的那些）；脂肪

10

15

20

25

酸酯、甘油酯、羊毛脂基衍生物、聚乙氧基化酯例如聚乙氧基化去水山梨糖醇脂肪酸酯、聚乙氧基化山梨醇脂肪酸酯和聚乙氧基化甘油脂肪酸酯；其他去水山梨糖醇衍生物，例如去水山梨糖醇酯；聚合物表面活性劑，例如無規共聚物、嵌段共聚物、醇酸 peg（聚乙二醇）樹脂、接枝聚合物或梳型聚合物和星型聚合物；聚乙二

醇類(peg)；聚乙二醇脂肪酸酯；有機矽劑表面活性劑；以及糖衍生物，例如蔗糖酯、烷基多聚糖甘和烷基多糖。

5 可用的陰離子型表面活性劑包括，但不限於：烷芳基磺酸以及它們的鹽；羧化醇或烷基酚乙氧基化物；二苯基磺酸鹽衍生物；木質素和木質素衍生物，例如木質素磺酸鹽；馬來酸或琥珀酸或它們的酸酐；烯烴磺酸鹽；磷酸酯，例如醇烷氧基化物的磷酸酯、烷基酚烷氧基化物的磷酸酯和苯乙烯基苯酚乙氧基化物的磷酸酯；蛋白質基表面活性劑；肌胺酸衍生物；苯乙烯基苯酚醚硫酸鹽；油和脂肪酸的硫酸鹽和磺酸鹽；醇的硫酸酯鹽；乙氧基化醇的硫酸酯鹽；胺和醯胺的磺酸鹽，例如 *N,N*-烷基牛磺酸鹽；苯、異丙基苯、甲苯、二甲苯以及十二烷基苯和十三烷基苯的磺酸鹽；稠合萘的磺酸鹽；萘和烷基萘的磺酸鹽；分餾石油的磺酸鹽；磺基琥珀醯胺酸鹽；和磺基琥珀酸鹽以及它們的衍生物如二烷基磺基琥珀醯胺酸鹽。

10

15

20 可用的陽離子型表面活性劑包括，但不限於：醯胺和乙氧基化醯胺；胺，例如 *N*-烷基丙二胺、三亞丙基三胺和二亞丙基四胺和乙氧基化胺、乙氧基化二胺和丙氧基化胺（用胺和環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或它們的混合物製備）；胺鹽如醋酸胺和二胺鹽；四級銨鹽類，例如四級銨鹽、乙氧基化四級銨鹽和雙四級銨鹽；以及胺氧化物，例如烷基二甲基胺氧化物和雙-(2-羥乙基)-烷基胺氧化物。

25 還可用於本發明組合物的是非離子型表面活性劑和陰離子型表面活性劑的混合物或非離子型表面活性

劑和陽離子型表面活性劑的混合物。非離子型、陰離子型和陽離子型表面活性劑以及它們的推薦用法在多篇已公佈的參考文獻中有公開，包括 *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, annual American and International Editions (由 McCutcheon 的分部，The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 出版)；Sisely 和 Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964；以及 A. S. Davidson 和 B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh 編輯，John Wiley and Sons, New York, 1987。

本發明的組合物還可以含有配方輔助劑和添加劑，本領域人員稱為配方助劑。這種配方助劑和添加劑可以控制：pH (緩衝劑)、加工期間的發泡 (消泡劑，例如聚有機矽氧烷 (如 Rhodorsil® 416))、活性成分的沉澱 (助懸劑)、黏度 (觸變增稠劑)、容器內的微生物生長 (抗微生物劑)、產品凍結 (防凍劑)、顏色 (染料/顏料分散體 (如 Pro-lzed® 紅著色劑)、洗脫 (成膜劑或黏著劑)、蒸發 (蒸發延緩劑) 和其他製劑屬性。成膜劑包括，例如聚醋酸乙烯酯、聚醋酸乙烯酯共聚物、聚乙烯基吡咯烷酮-醋酸乙烯基酯共聚物、聚乙烯醇、聚乙烯醇共聚物和蠟。配方輔助劑和添加劑的例子包括在 *McCutcheon's* 第 2 卷：*Functional Materials*, annual International and North American editions (由 McCutcheon 的部門 The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 出版)；和 PCT 公開申請案第 WO 03/024222 號中列出的那些。

可通過將成分簡單混合而製備溶液劑，包括乳油。如果旨在用作乳油的液體組合物的溶劑是不能與水混溶的，則通常加入乳化劑以在用水稀釋時使含有活性劑的溶劑乳化。可用介質磨對粒子直徑最多為 2,000 μm 的活性成分漿液進行濕磨以獲得平均直徑低於 3 μm 的
5 粒子。可將水性漿液製成成品懸浮劑濃縮物（參見例如美國專利第 3,060,084 號）或進一步通過噴霧乾燥處理以形成水分散性粒劑。乾製劑通常需要進行乾磨處理，乾磨處理產生範圍在 2 至 10 μm 的平均粒徑。粉塵劑和
10 粉劑可通過混合併通常在錘式粉碎機或流能磨中研磨而製備。顆粒劑和球劑可通過將活性材料噴在預製顆粒狀載體上或通過團聚技術來製備。參見 Browning, 「Agglomeration」, *Chemical Engineering*, 12 月 4 日, 1967, 第 147-48 頁、*Perry, Chemical Engineer's Handbook*, 第 4 版, McGraw-Hill, New York, 1963, 第
15 8-57 頁和後面內容，以及 PCT 公開申請案第 WO 91/13546 號。可如美國專利第 4,172,714 號中所述製備球劑。可如美國專利第 4,144,050 號、第 3,920,442 號和德國專利第 3,246,493 號中所教導的製備水分散性和水
20 溶性顆粒劑。可如美國專利第 5,180,587 號、第 5,232,701 號和美國專利第 5,208,030 號中所教導的製備片劑。可如 GB 2,095,558 和 U.S. 3,299,566 中教導的製備膜劑。

有關製劑領域的進一步信息，請參見 T. S. Woods, 「The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern
25 *Agriculture*」, *Pesticide Chemistry and Bioscience*、*The*

Food-Environment Challenge, T. Brooks 和 T. R. Roberts 編輯，Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, 第 120-133 頁。還可參見美國專利第 3,235,361 號的第 6 欄第 16 行至第 7 欄第 19 行和實例 10-41；U.S. 3,309,192 的第 5 欄第 43 行至第 7 欄第 62 行和實例 8、12、15、39、41、52、53、58、132、138-140、162-164、166、167 和 169-182；U.S. 2,891,855 的第 3 欄第 66 行至第 5 欄第 17 行和實例 1-4；Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, 第 81-96 頁；Hance 等人，*Weed Control Handbook*, 第 8 版，Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989；和 *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000。

在下面的實例中，所有的百分比均以重量計並且所有製劑均以常規方式製備。化合物號碼指索引表 A-B 中的化合物。在無須進一步推敲的情況下，據信所屬技術領域熟悉該項技術者使用前述說明即可利用本發明的全部內容。下列實例因此僅作為說明性而不以任何方式限制本揭露。百分計皆以重量計除非另有指明。

實例 A

高濃度濃縮物

化合物 1	98.5%
二氧化矽氣凝膠	0.5%
合成的無定形矽粉	1.0%

實例 B可濕性粉劑

化合物 2	65.0%
十二烷基酚聚乙二醇醚	2.0%
木質素磺酸鈉	4.0%
矽鋁酸鈉	6.0%
蒙脫石 (鍛燒)	23.0%

實例 C顆粒劑

化合物 3	10.0%
綠坡縷石顆粒劑 (低揮發性物質, 0.71/0.30 mm; 美國標準篩號 25-50 號篩)	90.0%

5

實例 D水懸浮劑

化合物 4	25.0%
水合綠坡縷石	3.0%
粗木質素磺酸鈣	10.0%
磷酸二氫鈉	0.5%
水	61.5.0%

實例 E擠出球劑

化合物 8	25.0%
無水硫酸鈉	10.0%
粗木質素磺酸鈣	5.0%
烷基萘磺酸鈉	1.0%
鈣基/鎂基膨潤土	59.0%

實例 F微乳劑

化合物 16	5.0%
聚乙烯基吡咯烷酮-醋酸乙烯基酯共聚物	30.0%
C ₈ -C ₁₀ 烷基多苷	30.0%
單油酸甘油酯	15.0%
水	20.0%

實例 G乳油

化合物 20	10.0%
山梨醇聚氧乙烯醚六油酸酯	20.0%
C ₆ -C ₁₀ 脂肪酸甲基酯	70.0%

5 通常在施用前，用水對諸如配方表中的那些的配方進行稀釋，以形成適於含水組合物。用於直接施用給植物或其部分的含水組合物（如噴霧桶使用的組合物）通常含有至少約 1 ppm 或更多（如 1 ppm 至 100 ppm）的本發明化合物。

10 本發明的化合物可用作植物病害控制劑。因而本發明還包括用於控制由真菌植物病原體引起的植物病害的方法，包括給要保護的植物或其部分，或給要保護的植物種子施用有效量的本發明化合物或含有所述化合物的殺真菌組合物。亦可將本發明的此態樣描述為用於
15 保護植物或植物種子免受由真菌病原體病害的方法，其包含施用一有效量的本發明化合物（例如本文所述的組成物）於植物（或其部分）或植物種子（直接或透過植物或植物種子的環境如生長介質）上。

本發明的化合物和/或組合物可控制由擔子菌綱、子囊菌綱、卵菌綱和半知菌綱類型中的範圍廣泛真菌植物病原體引起的病害。它們可有效控制範圍廣泛的植物病害，尤其是觀賞植物、草皮、蔬菜、田間作物、穀類作物和水果作物的葉病原體。這些病原體包括：卵菌綱病原體，包括疫霉(*Phytophthora*)病害，例如致病疫黴菌(*Phytophthora infestans*)、大雄疫霉(*Phytophthora megasperma*)、寄生疫霉(*Phytophthora parasitica*)、樟疫霉(*Phytophthora cinnamomi*)和辣椒疫霉(*Phytophthora capsici*)，腐霉(*Pythium*)病害，例如瓜果腐霉(*Pythium aphanidermatum*)，以及霜霉科病害，例如葡萄生單軸霉(*Plasmopara viticola*)、斜尖狀孢子菌屬物種(*Peronospora* spp.) (包括煙草霜黴菌(*Peronospora tabacina*)和寄生霜黴菌(*Peronospora parasitica*))、假霜霉屬物種(*Pseudoperonospora* spp.) (包括古巴假霜黴菌(*Pseudoperonospora cubensis*))和萵苣盤梗霉(*Bremia lactucae*)；子囊菌(Ascomycetes)病原體，包括鏈格孢菌(*Alternaria*)病害，例如索蘭尼氏鏈格孢(*Alternaria solani*)和芸苔鏈格孢菌(*Alternaria brassicae*)，球座菌(*Guignardia*)病害，例如葡萄球座菌(*Guignardia bidwell*)，黑星菌(*Venturia*)病害，例如蘋果黑星菌(*Venturia inaequalis*)，殼針孢(*Septoria*)病害，例如穎枯殼針孢菌(*Septoria nodorum*)和小麥殼針孢(*Septoria tritici*)，白粉菌(powdery mildew)病害，例如白粉菌屬物種(*Erysiphe* spp.) (包括禾白粉菌(*Erysiphe graminis*)和蓼白粉菌(*Erysiphe polygoni*))、葡萄鉤絲殼菌(*Uncinula*

necatur)、瓜單囊殼菌(*Sphaerotheca fuliginea*)和白叉絲單囊殼菌(*Podosphaera leucotricha*)、小麥基腐病菌(*Pseudocercospora herpotrichoides*)、葡萄孢(*Botrytis*)病害，例如灰葡萄孢菌(*Botrytis cinerea*)、褐腐菌(*Monilinia fructicola*)、核盤菌(*Sclerotinia*)病害，例如核盤菌(*Sclerotinia sclerotiorum*)、稻瘟病菌(*Magnaporthe grisea*)、葡萄擬莖點黴菌(*Phomopsis viticola*)、長蠕孢菌(*Helminthosporium*)病害，例如小麥褐斑長蠕孢霉(*Helminthosporium tritici repentis*)、圓核腔菌(*Pyrenophora teres*)、炭疽病，例如小叢殼屬物種(*Glomerella*)或刺盤孢屬物種(*Colletotrichum* spp.) (例如，禾生炭疽菌(*Colletotrichum graminicola*)和瓜類炭疽菌(*Colletotrichum orbiculare*)，以及禾頂囊殼菌(*Gaeumannomyces graminis*)；擔子菌(*Basidiomycetes*)病原體，包括由以下物種引發的銹病：柄銹菌屬物種(*Puccinia* spp.) (例如，隱匿柄銹菌(*Puccinia recondita*)、條形柄銹菌(*Puccinia striiformis*)、大麥柄銹菌(*Puccinia hordei*)、禾柄銹菌(*Puccinia graminis*)和花生柄銹菌(*Puccinia arachidis*)、咖啡駝孢銹菌(*Hemileia vastatrix*)和豆薯層銹菌(*Phakopsora pachyrhizi*)；其他病原體，包括：*Rutstroemia floccosu* (亦已知為 *Sclerotinia homoeocarpa*)；絲核菌屬物種(*Rhizoctonia* spp.) (例如立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*))；鐮刀菌(*Fusarium*)病害，例如粉紅鐮刀菌(*Fusarium roseum*)、禾谷鐮刀菌(*Fusarium graminearum*)和尖孢鐮刀菌 (*Fusarium oxysporum*)；大麗輪枝菌(*Verticillium dahliae*)病原體；

白絹菌 (*Sclerotium rolfsii*) 病原體；黑麥喙孢 (*Rynchosporium secalis*) 病原體；*Cercosporidium personatum*、花生尾孢菌 (*Cercospora arachidicola*) 和甜菜生尾孢 (*Cercospora beticola*)；以及這些病原體的其他近緣屬和種。除了它們的殺真菌活性外，該組合物或配混物還具有對抗諸如梨火疫病菌 (*Erwinia amylovora*)、野油菜黃單胞菌 (*Xanthomonas campestris*)、丁香假單胞菌 (*Pseudomonas syringae*) 和其他相關物種之類的細菌的活性。

植物病害控制通常通過在感染前或感染後，給要保護的植物的部分例如根、莖、葉、果實、種子、塊莖或鱗莖，或給待保護的植物在其中生長的基質（土壤和砂）施用有效量的本發明化合物來完成。還可以將化合物施用至種子，以保護種子和由種子發育的籽苗。還可以通過灌溉用水施用本化合物以處理植物。

這些化合物的施用比率（即殺真菌有效量）可受下列因素影響：如欲控制的植物病害、欲保護的植物品種、環境濕度與溫度，並應該由實際使用條件決定。所屬技術領域熟悉該項技術者可通過簡單實驗決定殺真菌有效量以達到必要的植物病害控制程度。當以小於約 1 g/ha 至約 5,000 g/ha 活性成分的比率處理時，葉通常可得到保護。當以每千克種子約 0.1 至約 10 g 的比率處理時，種子和籽苗通常可得到保護。

還可將本發明的化合物與一種或多種其他生物活性化合物或試劑，包括殺真菌劑、殺昆蟲劑、殺線蟲劑、殺細菌劑、殺蟎劑、除草劑、除草劑安全劑、生長調節

劑如昆蟲蛻皮抑制劑和生根刺激劑、化學絕育劑、化學傳訊物質、驅蟲劑、引誘劑、費洛蒙、誘食劑、植物營養素、其他生物活性化合物或昆蟲病原細菌、病毒或真菌混合，以形成產生更加範圍廣泛農業保護效果的多組分殺蟲劑。因而，本發明還涉及一種組合物，該組合物包含式 1 化合物（在殺真菌有效量下）和至少一種額外的生物活性化合物或試劑（在生物有效量下），並且可進一步包含至少一種表面活性劑、固體稀釋劑或液體稀釋劑。可將其他生物活性化合物或試劑配製成包含表面活性劑、固體或液體稀釋劑中的至少一者的組合物。對於本發明的混合物，可將一種或多種其他生物活性化合物或試劑與式 1 化合物一起配製，以形成預混物，或可將一種或多種其他生物活性化合物或試劑與式 1 化合物分開配製，並在施用前將製劑合併在一起（如在噴霧桶中合併），或者作為另一種選擇，將它們相繼施用。

值得注意的是除了式 1 化合物之外還包括至少一種選自由以下類型的化合物組成的組的殺真菌化合物：(1) 甲基苯并咪唑胺基甲酸酯(MBC)殺真菌劑；(2) 二甲醯亞胺類殺真菌劑；(3) 去甲基抑制劑(DMI)殺真菌劑；(4) 苯醯胺殺真菌劑；(5) 胺/嗎啉殺真菌劑；(6) 磷脂生物合成抑制劑殺真菌劑；(7) 甲醯胺殺真菌劑；(8) 羥基(2-胺基-)嘧啶殺真菌劑；(9) 苯胺基嘧啶殺真菌劑；(10) *N*-苯基胺基甲酸酯殺真菌劑；(11) 醌外部抑制劑(QoI)殺真菌劑；(12) 苯基吡咯殺真菌劑；(13) 喹啉殺真菌劑；(14) 脂質過氧化作用抑制劑殺真菌劑；(15) 黑素生物合成抑制劑-還原酶(MBI-R)殺真菌劑；(16) 黑素生

物合成抑制劑-去水酶(MBI-D)殺真菌劑；(17)羥苯胺(hydroxyanilide)殺真菌劑；(18)角鯊烯環氧酶抑制劑殺真菌劑；(19)多氧黴素殺真菌劑；(20)苯尿殺真菌劑；(21)醌內部抑制劑(QiI)殺真菌劑；(22)苯醯胺殺真菌劑；(23)吡喃醣醛酸抗生素殺真菌劑；(24)己吡喃糖基抗生素殺真菌劑；(25)吡喃葡萄糖基抗生素：蛋白質合成殺真菌劑；(26)吡喃葡萄糖基抗生素：海藻糖酶和肌醇生物合成殺真菌劑；(27)氰基乙醯胺肟殺真菌劑；(28)胺基甲酸酯殺真菌劑；(29)氧化磷酸化解偶聯殺真菌劑；(30)有機錫殺真菌劑；(31)羧酸殺真菌劑；(32)雜芳族殺真菌劑；(33)磷酸酯殺真菌劑；(34)酞胺酸殺真菌劑；(35)苯并三嗪殺真菌劑；(36)苯-磺醯胺殺真菌劑；(37)噻嗪酮殺真菌劑；(38)噻吩-甲醯胺殺真菌劑；(39)嘧啶醯胺(pyrimidinamide)殺真菌劑；(40)羧酸醯胺(CAA)殺真菌劑；(41)四環素抗生素殺真菌劑；(42)硫胺基甲酸酯殺真菌劑；(43)苯醯胺殺真菌劑；(44)宿主植物防禦誘導型殺真菌劑(Host plant defense induction fungicides)；(45)多位點接觸活性殺真菌劑；(46)除類型(1)至(45)外的殺真菌劑；以及類型(1)至(46)的化合物的鹽。

下面對這些類型的殺真菌化合物進行了更詳細的描述。

(1) 「甲基苯并咪唑胺基甲酸酯(MBC)殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號1)可通過在微管組裝期間與 β -微管蛋白結合而抑制有絲分裂。抑制微管組裝可中斷細胞分裂、細胞和細胞結構內的轉運。

甲基苯并咪唑胺基甲酸酯殺真菌劑包括苯并咪唑和苯硫尿酯殺真菌劑。苯并咪唑包括苯菌靈、多菌靈、麥穗靈和塞菌靈。苯硫尿酯類包括硫菌靈和甲基硫菌靈。

(2) 「二甲醯亞胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 2) 據說可通過干擾 NADH 細胞色素 c 還原酶來抑制真菌中的脂質過氧化作用。例子包括乙菌利、異菌尿、腐霉利和乙烯菌核利。

(3) 「去甲基抑制劑(DMI)殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 3) 可抑制 C14-去甲基酶，其在甾醇製備中起作用。甾醇，例如麥角甾醇，是膜結構和功能所需的，使得它們是功能細胞的細胞壁發育所必需的。因而，暴露於這些殺真菌劑導致敏感真菌生長異常並最終死亡。DMI 殺真菌劑分為幾種化學類型：唑類 (包括三唑和咪唑)、嘧啶類、哌嗪類和吡啶類。三唑類包括氧環唑、聯苯三唑醇、糠菌唑、環唑醇、苯醚甲環唑、烯唑醇 (包括烯唑醇-M)、氟環唑、腈苯唑、氟喹唑、氟哇唑、粉唑醇、己唑醇、亞胺唑、種菌唑、葉菌唑、腈菌唑、戊菌唑、丙環唑、丙硫菌唑、矽氟唑、戊唑醇、氟醚唑、三唑酮、三唑醇、滅菌唑和烯效唑。咪唑類包括克霉唑、抑霉唑、噁咪唑、咪鮮胺、稻瘟酯和氟菌唑。嘧啶類包括氯苯嘧啶醇和氟苯嘧啶醇。哌嗪類包括嗪胺靈。吡啶類包括啞斑肱。生物化學研究已經顯示，所有上述殺真菌劑是如 K. H. Kuck 等人在 *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (編輯), Gustav Fischer

Verlag: New York, 1995, 205-258 中所描述的 DMI 殺真菌劑。

5 (4) 「苯醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 4) 是卵菌綱真菌中的 RNA 聚合酶的特異性抑制劑。暴露於這些殺真菌劑的敏感真菌顯示出將尿甘整合進 rRNA 的能力下降。敏感真菌的生長和發育因暴露於這類殺真菌劑而受到阻止。苯醯胺殺真菌劑包括醯基丙胺酸、噁唑烷酮和丁內酯殺真菌劑。醯基丙胺酸類包括苯霜靈、苯霜靈-M、呋霜靈、甲霜靈和精甲霜靈/旋光甲霜靈。噁唑烷酮類包括噁霜靈。丁內酯類包括呋醯胺。

10 (5) 「胺/嗎啉殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 5) 可抑制甾醇生物合成途徑內的兩個靶位點 $\Delta^8 \rightarrow \Delta^7$ 異構酶和 Δ^{14} 還原酶。甾醇，例如麥角甾醇，是膜結構和功能所需的，使得它們是功能細胞的細胞壁發育所必需的。因而，暴露於這些殺真菌劑導致敏感真菌生長異常並最終死亡。胺/嗎啉殺真菌劑(也稱為非 DMI 甾醇生物合成抑制劑)包括嗎啉、哌啶和螺酮縮醇-胺殺真菌劑。嗎啉類包括 aldimorph、十二環嗎啉、丁苯嗎啉、十三嗎啉和垂嗎醯胺(trimorphamide)。

15 哌啶類包括苯銹啶和哌丙靈。螺酮縮醇-胺類包括螺環菌胺。

20 (6) 「磷脂生物合成抑制劑殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 6) 可通過影響磷脂生物合成來抑制真菌的生長。磷脂生物合成殺真菌劑包括硫

25

磷酸酯類和二硫戊環類殺真菌劑。硫磷酸酯類包括敵瘟磷、異稻瘟淨和吡嘧磷。二硫戊環類包括稻瘟靈。

(7) 「甲醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 7)可通過干擾三羧酸循環(TCA 循環)中稱為琥珀酸去氫酶的關鍵酶而抑制複合物 II(琥珀酸去氫酶)真菌呼吸作用。抑制呼吸作用可阻止真菌產生 ATP, 並因而可抑制生長和繁殖。甲醯胺類殺真菌劑包括苯醯胺類、呋喃甲醯胺類、氧硫雜環己二烯甲醯胺類、噻唑甲醯胺類、吡唑甲醯胺類和吡啶甲醯胺類。苯醯胺類包括麥銹靈、氟醯胺和滅銹胺。呋喃甲醯胺類包括甲呋醯胺。氧硫雜環己二烯甲醯胺類包括萎銹靈和氧化萎銹靈。噻唑甲醯胺類包括噻呋滅。吡唑甲醯胺類包括福拉比、吡噻菌胺、bixafen、isopyrazam、*N*-[2-(1*S*,2*R*)-[1,1'-二環丙基]-2-基苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺和 penflufen (*N*-[2-(1,3-二甲基丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺)。吡啶甲醯胺類包括啶醯菌胺。

(8) 「羥基(2-胺基-)嘧啶殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 8)可通過干擾腺苷去胺基酶而抑制核酸合成。例子包括乙嘧吩磺酸酯、甲菌定和乙嘧吩。

(9) 「苯胺基嘧啶殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 9)據說可抑制胺基酸甲硫胺酸的生物合成並破壞水解酶的分泌, 該水解酶在感染期間可溶解植物細胞。例子包括嘧菌環胺、嘧菌胺和嘧霉胺。

(10) 「*N*-苄基胺基甲酸酯殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 10) 可通過與 β -微管蛋白結合併破壞微管組裝而抑制有絲分裂。抑制微管組裝可中斷細胞分裂、細胞和細胞結構內的轉運。例子包括乙霉威。

(11) 「醌外部抑制劑(QoI)殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 11) 可通過影響泛醇氧化酶而抑制真菌中的複合物 III 線粒體呼吸。泛醇的氧化在細胞色素 bc_1 複合物的「醌外部」(Q_o)位點被阻斷，該複合物位於真菌的線粒體內膜。抑制線粒體呼吸可阻止正常的真菌生長和發育。醌外部抑制劑殺真菌劑(也稱為甲氧基丙烯酸酯(strobilurin)殺真菌劑)包括甲氧基丙烯酸酯、甲氧基胺基甲酸酯、肱基乙酸酯、肱基乙醯胺、噁唑烷二酮、二氫二噁嗪、咪唑啉酮和苄基胺基甲酸酯殺真菌劑。甲氧基丙烯酸酯類包括嘧菌酯、烯肱菌酯(SYP-Z071)、啖氧菌酯與唑菌酯(pyraoxystrobin(SYP-3343))。甲氧基胺基甲酸酯類包括唑菌胺酯與唑菌酯(pyrametostrobin(SYP-4155))。肱基乙酸酯類包括醚菌酯和肱菌酯。肱基乙醯胺類包括醚菌胺、苯氧菌胺、肱醚菌胺、 α -[甲氧基亞胺基]-*N*-甲基-2-[[[1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基]亞胺基]甲基]苯乙醯胺和2-[[[3-(2,6-二氯苯基)-1-甲基-2-丙烯-1-亞基]胺基]氧]甲基]- α -(甲氧基亞胺基)-*N*-甲基苯乙醯胺。噁唑烷二酮類包括噁唑菌酮。二氫二噁嗪類包括氟嘧菌酯。咪唑啉酮類包括咪唑菌酮。苄基胺基甲酸酯類包括 pyribencarb。

(12) 「苯基吡咯殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 12)可與真菌中的滲透脅迫信號轉導關聯而抑制 MAP 蛋白激酶。拌種咯和咯菌腈是該類殺真菌劑的例子。

5 (13) 「喹啉殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 13)據說可通過影響早期細胞信號傳導中的 G 蛋白而抑制信號轉導。已顯示,它們可干擾引起白粉病的真菌的萌發和/或附著胞形成。苯氧喹啉與替布喹為這類殺真菌劑的例子。

10 (14) 「脂質過氧化作用抑制劑殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 14)據說可抑制脂質過氧化作用,這可影響真菌的膜合成。這類殺真菌劑的成員,例如氣唑靈,還可以影響諸如呼吸作用和黑素生物合成之類的其他生物過程。脂質過氧化作用類殺真菌劑包括芳族碳和 1,2,4-噻二唑殺真菌劑。芳族碳類殺真菌劑包括聯苯、地茂散、氯硝胺、五氯硝基苯、四氯硝基苯和甲基立枯磷。1,2,4-噻二唑類殺真菌劑包括氣唑靈。

15 (15) 「黑素生物合成抑制劑-還原酶(MBI-R)殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 16.1)可抑制黑素生物合成中的萘甲叉還原步驟。黑素是某些真菌進行宿主植物感染所需要的。黑素生物合成抑制劑-還原酶殺真菌劑包括異苯并呋喃酮、吡咯並喹啉酮和三唑苯并噻唑殺真菌劑。異苯并呋喃酮包括四氯苯醌。吡咯並喹啉酮包括咯嗪酮。三唑苯并噻唑包括三環唑。

20

25

(16) 「黑素生物合成抑制劑-去水酶(MBI-D)殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 16.2)可抑制黑素生物合成中的小柱孢酮去水酶。黑素是某些真菌進行宿主植物感染所需要的。黑素生物合成抑制劑-去水酶殺真菌劑包括環丙烷甲醯胺、甲醯胺和丙醯胺殺真菌劑。環丙烷甲醯胺類包括加普胺。甲醯胺類包括雙氯菌胺。丙醯胺類包括禾草靈。

(17) 「羥苯胺殺真菌劑(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 17)可抑制在甾醇產生中起作用的C4-去甲基酶。實例包括環醯菌胺。

(18) 「角鯊烯-環氧酶抑制劑殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 18)可抑制麥角甾醇生物合成途徑中的角鯊烯-環氧酶。甾醇，例如麥角甾醇是膜結構和功能所需的，使得它們是功能細胞的細胞壁發育所必需的。因而，暴露於這些殺真菌劑導致敏感真菌生長異常並最終死亡。角鯊烯-環氧酶抑制劑殺真菌劑包括硫胺基甲酸酯和烯丙胺殺真菌劑。硫胺基甲酸酯類包括稗草丹。烯丙胺類包括茶替芳和特比萘芬。

(19) 「多氧黴素殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 19)可抑制幾丁質合成酶。實例包括多氧黴素。

(20) 「苯尿殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 20)據說可影響細胞分裂。實例包括戊菌隆。

(21) 「醌內部抑制劑(QiI)殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 21)可通過影響泛醇還原

酶而抑制真菌中的複合體 III 線粒體呼吸。泛醇的還原
在細胞色素 bc_1 複合物的「醌內部」(Q_i)位點被阻斷，
該複合物位於真菌的線粒體內膜。抑制線粒體呼吸可阻
止正常的真菌生長和發育。醌內部抑制劑殺真菌劑包括
5 氰基咪唑和胺磺醯基三唑殺真菌劑。氰基咪唑類包括氰
霜唑。胺磺醯基三唑類包括吡唑磺菌胺。

(22) 「苯醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委
員會(FRAC)編號 22) 可通過與 β -微管蛋白結合併破壞
微管組裝而抑制有絲分裂。抑制微管組裝可中斷細胞分
裂、細胞和細胞結構內的轉運。實例包括苯醯菌胺。
10

(23) 「烯醇吡喃糖醛酸抗生素殺真菌劑」(殺真菌
劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 23) 可通過影響蛋白
質生物合成來抑制真菌的生長。實例包括滅瘟素。

(24) 「己吡喃基抗生素殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥
性行動委員會(FRAC)編號 24) 可通過影響蛋白質生物
合成來抑制真菌的生長。實例包括春雷黴素。
15

(25) 「吡喃葡萄糖基抗生素：蛋白質合成殺真菌
劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 25) 可通
過影響蛋白質生物合成來抑制真菌的生長。實例包括鏈
黴素。
20

(26) 「吡喃葡萄糖基抗生素：海藻糖酶和肌醇生
物合成殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)
編號 26) 可抑制肌醇生物合成途徑中的海藻糖酶。實
例包括有效黴素。

(27) 「氰基乙醯胺肟殺真菌劑 (殺真菌劑抗藥性
行動委員會(FRAC)編號 27) 包括霜尿氰。
25

(28) 「胺基甲酸酯殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 28) 據認為是真菌生長的多位點抑制劑。據認為它們會干擾細胞膜內的脂肪酸合成，其隨後會破壞細胞膜滲透性。霜霉威、霜霉威鹽酸鹽、iodocarb 和胺乙威是這類殺真菌劑的例子。

(29) 「氧化磷酸化解偶聯殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 29) 可通過氧化磷酸化解偶聯來抑制真菌的呼吸。抑制呼吸可阻止正常的真菌生長和發育。這類殺真菌劑包括 2,6-二硝基苯胺類如氟啶胺、嘧啶酮脒類如嘧菌脒，以及二硝基苯基巴豆酸酯類，例如消蟎普、meptyldinocap 和樂殺蟎。

(30) 「有機錫殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 30) 可抑制氧化磷酸化途徑中的三磷酸腺苷(ATP)合成酶。實例包括醋酸三苯錫、三苯錫氣和氫氧三苯錫。

(31) 「羧酸殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 31) 可通過影響去氧核糖核酸(DNA)II 型拓撲異構酶(促旋酶)來抑制真菌的生長。實例包括惡喹酸。

(32) 「雜芳族殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 32) 據認為可影響 DNA/核糖核酸(RNA)合成。雜芳族殺真菌劑包括異噁唑和異噻唑啉酮殺真菌劑。異噁唑類包括惡霉靈而異噻唑啉酮類包括辛噻酮。

(33) 「磷酸酯殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 33) 包括磷酸及其多種鹽，包括三乙磷酸鋁。

5 (34) 「鄰胺甲醯苯甲酸殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 34) 包括葉枯酞。

(35) 「苯并三嗪殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 35) 包括咪唑嗪。

(36) 「苯-磺醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 36) 包括磺菌胺。

10 (37) 「噻嗪酮殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 37) 包括噻菌酮。

(38) 「噻吩-醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 38) 據認為可影響 ATP 的產生。實例包括矽噻菌胺。

15 (39) 「嘧啶醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 39) 可通過影響磷脂生物合成來抑制真菌的生長並且包括氟嘧菌胺。

20 (40) 「羧酸醯胺(CAA)殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 40) 據認為可抑制磷脂的生物合成和細胞壁沉積。對這些過程的抑制可防止生長並導致靶真菌的死亡。羧酸醯胺殺真菌劑包括肉桂酸醯胺殺真菌劑、valinamide carbamate 和扁桃酸醯胺殺真菌劑。肉桂酸醯胺類包括烯醯嗎啉和氟嗎啉。valinamide carbamates 包括苯噻菌胺、苯噻菌胺-異丙基、丙森鋅、valifenalate 和 valiphenal。扁桃酸醯胺類包括雙炔醯菌胺、*N*-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧]-3-甲氧苯基]

乙基]-3-甲基-2-[(甲磺醯基)胺基]丁醯胺和
N-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧]-3-甲氧苯基]乙
 基]-3-甲基-2-[(乙磺醯基)胺基]丁醯胺。

(41) 「四環素抗生素殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性
 5 行動委員會(FRAC)編號 41)可通過影響複合物 1 煙醯
 胺腺嘌呤二核甘酸(NADH)氧化還原酶來抑制真菌的生
 長。實例包括氧四環素。

(42) 「硫胺基甲酸酯殺真菌劑(b42)」(殺真菌劑抗
 藥性行動委員會(FRAC)編號 42)包括磺菌威。

(43) 「苯醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委
 10 員會(FRAC)編號 43)可通過類血影蛋白的離域作用來
 抑制真菌生長。實例包括 acylpicolide 殺真菌劑，例如
 氟吡菌胺和氟吡菌醯胺(fluopyram)。

(44) 「宿主植物防禦誘導型殺真菌劑」(殺真菌劑
 15 抗藥性行動委員會(FRAC)編號 P)可誘導宿主植物的防
 禦機制。宿主植物防禦誘導型殺真菌劑包括苯并-噻二
 唑、苯并異噻唑和噻二唑-甲醯胺殺真菌劑。苯并-噻二
 唑類包括噻二唑素-S-甲基。苯并異噻唑類包括烯丙苯
 噻唑。噻二唑-甲醯胺類包括噻醯菌胺和異噻菌胺。

(45) 「多位點接觸殺真菌劑」可通過多作用位點
 20 抑制真菌生長並且具有接觸/預防活性。這類殺真菌劑
 包括：(45.1)「銅殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員
 會(FRAC)編號 M1)」、(45.2)「硫殺真菌劑」(殺真菌劑
 抗藥性行動委員會(FRAC)編號 M2)」、(45.3)「二硫胺基
 25 甲酸酯殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)
 編號 M3)」、(45.4)「酞亞胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性

行動委員會(FRAC)編號 M4)、(45.5)「氣腈殺真菌劑」
 (殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 M5)、(45.6)
 「磺醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會
 (FRAC)編號 M6)、(45.7)「胍殺真菌劑」(殺真菌劑抗
 藥性行動委員會(FRAC)編號 M7)、(45.8)「三嗪殺真菌
 劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 M8)和
 (45.9)「醌殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會
 (FRAC)編號 M9)。「銅殺真菌劑」是含有銅的無機化合
 物，通常為銅(II)氧化狀態；實例包括氧氯化銅、硫酸
 銅和氫氧化銅，包括諸如波爾多液(三鹼基硫酸銅)之
 類的組合物。「硫殺真菌劑」是含有硫原子環或硫原子
 鏈的無機化學試劑；實例包括元素硫。「二硫胺基甲酸
 酯殺真菌劑」含有二硫胺基甲酸酯分子部分；實例包
 括：代森錳鋅、代森聯、甲基代森鋅、福美鐵、代森錳、
 福美雙、代森鋅和福美鋅。「酞亞胺殺真菌劑」含有酞
 亞胺分子部分；實例包括滅菌丹、克菌丹和敵菌丹。「氣
 腈殺真菌劑」含有經氯和氰基取代的芳族環；實例包括
 四氯二氰苯。「磺醯胺殺真菌劑」包括苯氰磺胺和甲苯
 氰磺胺。「胍殺真菌劑」包括十二烷基胍、雙胍辛鹽、
 iminoctadine albesilate 和雙胍辛乙酸鹽。「三嗪殺真菌
 劑」包括敵菌靈。「醌殺真菌劑」包括二氰蒽醌。

(46) 「非(1)至(45)類型殺真菌劑的殺真菌劑」包括
 某些其作用模式未知的殺真菌劑。這些殺真菌劑包括：
 (46.1)「噻唑甲醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委
 員會(FRAC)編號 U5)、(46.2)「苯基-乙醯胺殺真菌劑」
 (殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 U6)、(46.3)

「噻唑酮殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 U7)、(46.4)「二苯甲酮殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 U8)和(46.5)「三唑嘧啶殺真菌劑」。噻唑甲醯胺類包括韓樂寧。苯基-乙醯胺類包括環氟菌胺和 *N*-[[[(環丙基甲氧基)胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]-亞甲基]苯乙醯胺。噻唑酮類包括丙氧噻啉和 2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4*H*-1-苯并吡喃-4-酮。二苯甲酮類包括苯菌酮。三唑嘧啶殺真菌劑包括 ametoctradin。(b46)類還包括：bethoxazin、甲胛鐵銨(甲基胛酸鐵)、硝吡咯菌素、滅蟎猛、*N*-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲磺醯基)胺基]丁醯胺、*N*-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(乙磺醯基)胺基]丁醯胺、2-[[2-氯-5-(三氟甲基)苯基]硫]-2-[3-(2-甲氧苯基)-2-噻唑烷亞基]乙腈、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-3-異噁唑烷基]吡啶、4-氯苯基 *N*-[1-[[[1-(4-氯基苯基)乙基]磺醯基]甲基]丙基]胺基甲酸酯、5-氯-6-(2,4,6-三氟苯基)-7-(4-甲基哌啶-1-基)[1,2,4]三唑[1,5-*a*]嘧啶、*N*-(4-氯-2-硝基苯基)-*N*-乙基-4-甲基苯磺醯胺、*N*-[[[(環丙基甲氧基)胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]亞甲基]苯乙醯胺、*N*'-[4-[4-氯-3-(三氟甲基)苯氧基]-2,5-二甲基苯基]-*N*-乙基-*N*-甲基甲脒、1-[(2-丙烯基硫)羰基]-2-(1-甲基乙基)-4-(2-甲基苯基)-5-胺基-1*H*-吡唑-3-酮和 1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑]-1-哌啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-1-yl]-乙酮。

因此，值得注意的是這樣一種混合物（即組合物），其包含式 1 化合物和至少一種選自前述(1)至(46)類殺真菌劑的殺真菌化合物。同樣值得注意的是這樣一種組合物，其包含所述混合物（為殺真菌有效量）並且還包含至少一種選自表面活性劑、固體稀釋劑和液體稀釋劑的另外的組分。特別值得注意的是這樣一種混合物（即組合物），其包含式 1 化合物和至少一種選自上面結合類型(1)至(46)所列出的具體化合物的殺真菌化合物。同樣值得特別注意的是這樣一種組合物，其包含所述混合物（為殺真菌有效量）並且還包含至少一種選自表面活性劑、固體稀釋劑和液體稀釋劑的另外的表面活性劑。

可與本發明化合物一起配製的其他生物活性化合物或試劑的例子是：殺昆蟲劑，例如阿維菌素、乙醯甲胺磷、吡蟲清、amidoflumet (S-1955)、阿滅丁、印楝素、甲基谷硫磷、聯苯菊酯、聯苯腈酯、噻嗪酮、克百威、殺螟丹、氯蟲醯胺、溴蟲腈、氟啶尿、毒死蜱、甲基毒死蜱、環蟲醯腈、塞蟲胺、cyantraniliprole (3-溴-1-(3-氟-2-吡啶基)-N-[4-氟基-2-甲基-6-[(甲基胺基)羰基]苯基]-1H-吡啶-5-甲醯胺)、丁氟螨酯、氟氯氰菊酯、高效氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、高效氯氟氰菊酯、氯氟菊酯、滅蠅胺、溴氰菊酯、丁噻尿、二嗪磷、狄氏劑、除蟲尿、四氟甲醚菊酯、樂果、呋蟲胺、苯蟲醚、依馬菌素、硫丹、S-氟戊菊酯、乙蟲清、苯硫威、苯氧威、甲氰菊酯、氟戊菊酯、氯蟲腈、氟啶蟲醯胺、氯蟲醯胺、氟氯戊菊酯、氟胺氰菊酯、flufenerim (UR-50701)、氯蟲尿、fonophos、氯蟲醯腈、氟鈴尿、氯蟻肟、吡蟲啉、

節蟲威、異柳磷、虱蟎尿、馬拉硫磷、氰氟蟲脞、四聚
 乙醛、甲胺磷、殺撲磷、滅多威、烯蟲酯、甲氧滴滴涕、
 甲氧苄氟菊酯、倍脈心肱、久效磷、甲氧蟲醯肼、菸鹼、
 5 烯啉蟲胺、硝蟲噻嗪、雙苯氟尿、多氟尿(XDE-007)、
 草胺醯、對硫磷、甲基對硫磷、氯菊酯、甲拌磷、伏殺
 硫磷、亞胺硫磷、磷胺、抗蚜威、丙溴磷、丙氟菊酯、
 吡蚜酮、pyrafluprole、除蟲菊酯、啉蟲丙醚、
 pyrifluquinazon、pyriprole、蚊蠅醚、魚藤酮、魚尾汀
 鹼、spinetoram、艾克敵、螺蟎酯、螺甲蟎酯(BSN 2060)、
 10 螺蟲乙酯、硫丙磷、抑蟲肼、氟苯尿、七氟菊酯、特丁
 硫磷、殺蟲威、噻蟲啉、噻蟲嗪、硫雙威、殺蟲雙、啉
 蟲醯胺、四溴菊酯、啉蚜威、敵百蟲和殺鈴尿；和生物
 製劑，包括昆蟲病原細菌，例如蘇芸金桿菌(*Bacillus*
thuringiensis)亞種亞莎華(*aizawai*)，蘇芸金桿菌亞種庫
 15 斯塔克(*kurstaki*)，以及膠囊化的蘇芸金桿菌的 δ -內毒素
 (例如，Cellcap、MPV、MPVII)；昆蟲病原真菌，例
 如綠僵菌；和昆蟲病原病毒，包括桿狀病毒、核型多角
 體病毒(NPV)如 HzNPV、AfNPV；以及顆粒症病毒(GV)
 如 CpGV。

20 本發明的化合物及其組合物可以施用給經遺傳轉
 化而表達對無脊椎害蟲有毒性的蛋白質(例如蘇芸金桿
 菌(*Bacillusthuringiensis*) δ -內毒素)的植物。外源施用的
 本發明殺真菌化合物的作用可因表達毒素蛋白而增效。

25 有關農業保護劑(即殺昆蟲劑、殺真菌劑、殺線蟲
 劑、殺蟎劑、除草劑和生物製劑)的一般參考文獻包括：
The Pesticide Manual, 第 13 版，C. D. S. Tomlin (編

輯)，British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 和 *The BioPesticide Manual*, 第 2 版，L. G. Copping (編輯)，British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001。

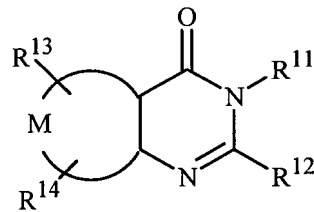
5 在一些情況下，本發明化合物與其他生物活性（特別是殺真菌）化合物或試劑（即活性成分）的組合可產生增強（即協同）效應。減少釋放進環境中的活性成分的量，同時確保有效的蟲害控制一直都是所希望的。當殺真菌活性成分的協同作用在可產生農藝學上令人滿意的真菌控制水平的施用率下發生時，這樣的組合對於減小作物生產成本和減小環境負荷而言是有利的。

10 值得注意的是式 1 化合物與至少一種其他殺真菌活性成分的組合。值得特別注意的是這樣的組合，在該組合中其他殺真菌活性成分具有不同於式 1 化合物的作用位點。在一些情況下，對於耐藥性管理而言，與至少一種具有相似控制譜但具有不同作用位點的其他殺真菌活性成分的組合將是特別有利的。因此，本發明的組合物還可以包含生物有效量的至少一種另外的殺真菌活性成分，其具有相似控制譜但具有不同的作用位點。

20 值得特別注意的是這樣的組合物，除了式 1 化合物外，其還包含至少一種選自如下的化合物：
25 (1)alkylenebis(二硫胺基甲酸酯)殺真菌劑；(2)霜尿氫；(3)苯醯胺殺真菌劑；(4)嘧啶酮殺真菌劑；(5)四氯二氫苯；(6)作用於真菌線粒體呼吸電子傳遞位點的複合物 II 的甲醯胺類；(7)苯氧喹啉；(8)苯菌酮；(9)環氟菌胺；

(10) 噻菌環胺；(11) 銅類化合物；(12) 酞亞胺殺真菌劑；
 (13) 三乙膦酸鋁；(14) 苯并咪唑殺真菌劑；(15) 氰霜唑；
 (16) 氟啶胺；(17) 丙森鋅；(18) 霜霉威；(19) 有效黴素；
 (20) 二氯苯基二甲醯亞胺殺真菌劑；(21) 苯醯菌胺；(22)
 5 氟吡菌胺；(23) 雙炔醯菌胺；(24) 作用於磷脂生物合成
 和細胞壁沉積的羧酸醯胺；(25) 烯醯嗎啉；(26) 非-DMI
 甾醇生物合成抑制劑；(27) 甾醇生物合成中的去甲基酶的
 抑制劑；(28) bc_1 複合物殺真菌劑；以及化合物(1)至(28)
 的鹽。

10 下面對殺真菌化合物類型進行了更詳細的描述。
 嘧啶酮殺真菌劑（第(4)組）包括式 A1 化合物：



A1

15 其中 M 形成稠合的苯基、噻吩或吡啶環；R¹¹ 為 C₁-C₆
 烷基；R¹² 為 C₁-C₆ 烷基或 C₁-C₆ 烷氧基；R¹³ 為鹵素；
 而 R¹⁴ 為氫或鹵素。

嘧啶酮殺真菌劑在 PCT 專利公開申請案第 WO
 94/26722 號和美國專利第 6,066,638、6,245,770、
 20 6,262,058 和 6,277,858 號中有描述。值得注意的是選自
 下列組的嘧啶酮殺真菌劑：6-溴-3-丙基-2-丙氧基
 -4(3H)-喹唑酮、6,8-二碘-3-丙基-2-丙氧基-4(3H)-喹唑

酮、6-碘-3-丙基-2-丙氧基-4(3*H*)-喹唑酮(丙氧喹啉)、
 6-氯-2-丙氧基-3-丙基噻吩並[2,3-*d*]嘧啶-4(3*H*)-酮、6-
 溴-2-丙氧基-3-丙基噻吩並[2,3-*d*]嘧啶-4(3*H*)-酮、7-溴
 5 -2-丙氧基-3-丙基噻吩並[3,2-*d*]嘧啶-4(3*H*)-酮、6-溴-2-
 丙氧基-3-丙基吡啶並[2,3-*d*]嘧啶-4(3*H*)-酮、6,7-二溴-2-
 丙氧基-3-丙基噻吩並[3,2-*d*]嘧啶-4(3*H*)-酮和 3-(環丙基
 甲基)-6-碘-2-(丙硫基)吡啶並[2,3-*d*]嘧啶-4(3*H*)-酮。

甾醇生物合成抑制劑(第(27)組)可通過抑制甾醇
 生物合成途徑中的酶來控制真菌。去甲基酶-抑制性殺
 10 真菌劑在真菌的甾醇生物合成途徑中具有通用的作用
 位點,涉及在羊毛甾醇或 24-亞甲基聚二水羊毛甾醇(在
 真菌中其是甾醇的前體)的位置 14 處抑制去甲基作
 用。作用於該位點的化合物常常稱為去甲基酶抑制劑、
 DMI 殺真菌劑或 DMI。在生化文獻中有時會將去甲基
 15 酶用其他名稱表示,包括細胞色素 P-450 (14DM)。去甲
 基酶(例如)在 *J. Biol. Chem.* **1992**, *267*, 13175-79 和其
 中引用的參考文獻中有描述。DMI 殺真菌劑分為幾種化
 學類型:唑類(包括三唑和咪唑)、嘧啶類、哌嗪類和
 吡啶類。三唑類包括氧環唑、糠菌唑、環唑醇、苯醚甲
 20 環唑、烯唑醇(包括烯唑醇-M)、氟環唑、乙環唑、腈
 苯唑、氟喹唑、氟哇唑、粉唑醇、己唑醇、亞胺唑、種
 菌唑、葉菌唑、腈菌唑、戊菌唑、丙環唑、丙硫菌唑、
 喹唑(quinconazole)、矽氟唑、戊唑醇、氟醚唑、三唑酮、
 三唑醇、滅菌唑和烯效唑。咪唑類包括克霉唑、益康唑、
 25 抑霉唑、異康唑、咪康唑、噁咪唑、咪鮮胺和氟菌唑。
 嘧啶類包括氯苯嘧啶醇、氟苯嘧啶醇和嘧菌醇。哌嗪類

包括噻胺靈。吡啶類包括丁硫啶和啶斑脞。生物化學研究已經顯示，所有上述殺真菌劑是如 K. H. Kuck 等人在 *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr(編輯), Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 205-258 中所描述的 DMI 殺真菌劑。

bc_1 複合物殺真菌劑 (第 28 組) 具有抑制線粒體呼吸鏈中的 bc_1 複合物的殺真菌作用模式。在生化文獻中有時將 bc_1 複合物用其他名稱來表示，包括電子傳遞鏈的複合物 III，和輔酶 Q-H₂:細胞色素 *c* 氧化還原酶。該複合物獨特地由酶學委員會編碼 EC1.10.2.2 確定。 bc_1 複合物在 (例如) *J. Biol. Chem.* **1989**, 264, 14543-48; *Methods Enzymol.* **1986**, 126, 253-71 和其中引用的參考文獻中有描述。Strobilurin 殺真菌劑如嘧菌酯、醚菌胺、烯肱菌酯(SYP-Z071)、氟嘧菌酯、醚菌酯、苯氧菌胺、肱醚菌胺、啶氧菌酯、唑菌胺酯、唑胺菌酯、唑菌酯和肱菌酯已知具有這種作用模式 (H. Sauter 等人, *Angew. Chem. Int. Ed.* **1999**, 38, 1328-1349)。抑制線粒體呼吸鏈中的 bc_1 複合物的其他殺真菌化合物包括噁唑菌酮和咪唑菌酮。

Alkylenebis (二硫胺基甲酸酯) (第(1)組) 包括諸如代森錳鋅、代森錳、甲基代森鋅和代森鋅之類的化合物。苯基醯胺類 (第(3)組) 包括諸如甲霜靈、苯霜靈、呋霜靈和噁霜靈之類的化合物。甲醯胺類 (第(6)組) 包括諸如啶醯菌胺、萎銹靈、甲呋醯胺、氟醯胺、福拉比、滅銹胺、氧化萎銹靈、噁呋滅、吡噻菌胺和 *N*-[2-(1,3-

二甲基丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺
 (PCT 專利公開申請案第 WO 2003/010149) 之類的化
 合物, 並且已知可通過破壞呼吸電子傳遞鏈中的複合物
 II (琥珀酸酯去氫酶) 來抑制線粒體功能。銅類化合物
 5 (第(11)組) 包括諸如氧氯化銅、硫酸銅和氫氧化銅之
 類的化合物, 包括諸如波爾多液(三鹼基硫酸銅) 之類
 的組合物。酞亞胺(第(12)組) 包括諸如滅菌丹和克菌
 丹之類的化合物。苯并咪唑殺真菌劑(第(14)組) 包括
 苯菌靈和多菌靈。二氯苯基二甲醯亞胺殺真菌劑(第(20)
 10 組) 包括乙菌利、菌核利、異菌尿、isovaledione、
 myclozolin、腐霉利和乙烯菌核利。

非-DMI 甾醇生物合成抑制劑(第(26)組) 包括嗎啉
 和哌啶殺真菌劑。嗎啉類和哌啶類是這樣的甾醇生物合
 成抑制劑, 據顯示其是在由 DMI 甾醇生物合成抑制劑
 15 (第(27)組) 實現抑制後的點進行甾醇生物合成途徑中
 的抑制步驟。嗎啉類包括 aldimorph、十二環嗎啉、丁
 苯嗎啉、十三嗎啉和垂嗎醯胺。哌啶類包括苯銹啶。

還為眾人所知的是式 1 化合物與嘧菌酯、醚菌酯、
 肟菌酯、唑菌胺酯、啶菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺
 20 /fenominostrobin、多菌靈、百菌清、苯氧喹啉、苯菌酮、
 環氟菌胺、苯銹啶、丁苯嗎啉、糠菌唑、環唑醇、苯醚
 甲環唑、氟環唑、腈苯唑、氟哇唑、己唑醇、種菌唑、
 葉菌唑、戊菌唑、丙環唑、丙氧喹啉、丙硫菌唑、戊唑
 醇、滅菌唑、噁唑菌酮、咪鮮胺、吡噻菌胺和啶醯菌胺
 25 (nicobifen) 的組合。

對於更好控制由真菌植物病原體引起的植物病害
(如使用率較低或可控制的植物病原體範圍更廣)或抗
藥性管理較佳的是本發明化合物與選自如下組的殺菌
劑的混合物：嘧菌酯、醚菌酯、肟菌酯、唑菌胺酯、啶
5 氧菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺/fenominostrobin、苯氧喹啉、
苯菌酮、環氟菌胺、苯銹啶、丁苯嗎啉、環唑醇、氟環
唑、氟哇唑、葉菌唑、丙環唑、丙氧喹啉、丙硫菌唑、
戊唑醇、滅菌唑、噁唑菌酮和吡噻菌胺。

尤其較佳的混合物(化合物號指索引表 A-B 中的化
10 合物)選自如下組：化合物 1、化合物 2、化合物 3、
化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物
20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或
化合物 44 與 ametoctradin，化合物 1、化合物 2、化合
物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化
15 合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物
43 或化合物 44 與嘧菌酯的組合；化合物 1、化合物 2、
化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、
化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物
43 或化合物 44 與 bixafen 的組合；化合物 1、化合物 2、
20 化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、
化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物
43 或化合物 44 與啶醯菌胺；化合物 1、化合物 2、化合
物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化
25 合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物
43 或化合物 44 與環氟菌胺的組合；化合物 1、化合物
2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物

18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與環唑醇的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與噻菌胺的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與氟環唑的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與凡殺同的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與苯銹啉的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與丁苯嗎啉的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與氟吡菌醯胺的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與丁苯嗎啉的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與氟哇

唑的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、
化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物
29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與
丁苯嗎啉的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化
5 合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、
化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合
物 44 與 flutianil 的組合；化合物 1、化合物 2、化合物
3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合
物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43
10 或化合物 44 與丁苯嗎啉的組合；化合物 1、化合物 2、
化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、
化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物
43 或化合物 44 與 isopyrazam 的組合；化合物 1、化合
物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化
15 合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物
42、化合物 43 或化合物 44 與異噻菌胺的組合；化合
物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合
物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、
化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與醚菌酯的組合；
20 化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、
化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物
35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與雙炔醯菌胺
的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化
合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、
25 化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與
meptyldinocap 的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、

化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與葉菌唑的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、
5 化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與苯氧菌胺/fenominostrobin 的組合；
化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、
10 化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與苯菌酮的組合；
化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、
15 化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與 penflufen 的組合；
化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、
20 化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與
啉氧菌酯的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、
25 化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、
化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或
化合物 44 與丙環唑的組合；化合物 1、化合物 2、
化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、

化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物
43 或化合物 44 與丙硫菌唑的組合；化合物 1、化合物
2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物
18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化
5 合物 43 或化合物 44 與唑菌胺酯的組合；化合物 1、化
合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、
化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物
42、化合物 43 或化合物 44 與唑胺菌酯的組合；化
合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化
10 合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、
化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與唑菌酯的組合；
化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、
化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物
35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與 pyribencarb
15 的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化
合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、
化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與苯氧
喹啉的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、
化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物
20 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與
戊唑醇的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合
物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、
化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合
物 44 與替布嗪的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、
25 化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物
20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或

化合物 44 與脲菌酯的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與滅菌唑的組合；化合物 1、化合物 2、
5 化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與 valifenalate 的組合。

對於使用一或多個各式其他生物有效化合物或劑（即混合配偶體）的實施例而言，這些各式混合配偶體（加總）與式 1 化合物之重量比例典型為約 1:3000 至約 3000:1 間。值得注意的重量比例為約 1:300 至約 300:1 間（例如約 1:3000 至約 3000:1 間的比例）。本領域技術人員可通過簡單的實驗容易地確定達到所需植物病害生物活性範圍所必要的活性成分生物有效量。將會明白的是，包括這些額外組分可擴展病害控制範圍而超過單獨使用式 1 化合物所能控制的範圍。再者，某些殺真菌劑的組合可展現大於加成性（即協同作用）的效果，而提供具有商業重要性的植物病害控制水準。

本發明混合物、組成物與方法的說明如表 A1 所示，其揭露式 1 化合物與其他生物活性化合物的混合物。特別是，揭露化合物 4（見索引表 A 的化合物描述）與列於行頭「混合配偶體」下化合物的混合物，以及兩種列於行頭「比例說明」下的特定重量比例。例如，第一列揭露化合物 4 與阿拉酸式苯-S-甲基的混合物，化合物 4 與阿拉酸式苯-S-甲基的重量比例為 1:3 或 3:1。

表 A1

化合物	混合配偶體	比例說明(*)	
4	阿拉酸式苯-S-甲基	1:3	3:1
4	aldimorph	1:50	1:7
4	吡啶菌胺	1:10	1:2
4	敵菌靈	1:150	1:23
4	氧環唑	1:15	1:2
4	嘧菌酯	1:20	1:3
4	苯霜靈	1:10	1:2
4	苯霜靈-M	1:7	2:1
4	麥銹靈	1:30	1:4
4	苯菌靈	1:75	1:9
4	苯噻菌胺	1:3	2:1
4	苯噻菌胺-異丙基	1:3	2:1
4	bethoxazin	1:100	1:12
4	樂殺蟎	1:100	1:12
4	聯苯基	1:100	1:12
4	聯苯三唑醇	1:25	1:5
4	bixafen	1:15	1:3
4	滅瘟素	1:1	5:1
4	波爾多液(三鹼基硫酸銅)	1:300	1:34
4	啶醯菌胺	1:30	1:4
4	糠菌唑	1:20	1:3
4	乙嘧酚磺酸酯	1:2	5:1
4	敵菌丹	1:100	1:12
4	克菌丹	1:100	1:12
4	多菌靈	1:75	1:9
4	萎銹靈	1:30	1:4
4	加普胺	1:20	1:3
4	地茂散	1:700	1:89
4	四氯二氧苯	1:100	1:12
4	乙菌利	1:75	1:12
4	克霉唑	1:20	1:3
4	氧氯化銅	1:400	1:45
4	銅鹽如硫酸銅和氫氧化銅	1:50	1:6
4	氟霜唑	1:7	1:2
4	環氟菌胺	1:2	4:1
4	霜尿氟	1:12	1:2
4	環唑醇	1:8	1:2
4	嘧菌環胺	1:30	1:4

化合物	混合配偶體	比例說明(*)	
4	苯氯磺胺	1:100	1:12
4	雙氯氟菌胺	1:100	1:12
4	噻菌酮	1:25	1:3
4	氯硝胺	1:100	1:12
4	乙霉威	1:50	1:6
4	苯醚甲環唑	1:5	2:1
4	氟啉菌胺	1:100	1:12
4	甲菌定	1:2	5:1
4	烯醯嗎啉	1:20	1:4
4	醚菌胺	1:15	1:2
4	烯唑醇	1:6	2:1
4	烯唑醇 M	1:5	2:1
4	消螨普	1:15	1:3
4	二氯蔥醌	1:33	1:6
4	十二環嗎啉	1:50	1:7
4	十二烷基胍	1:70	1:12
4	敵瘟磷	1:25	1:3
4	烯肟菌酯	1:15	1:2
4	氟環唑	1:8	1:1
4	韓樂寧	1:15	1:3
4	氣唑靈	1:50	1:6
4	噁唑菌酮	1:15	1:2
4	咪唑菌酮	1:13	1:2
4	氣苯嘧啶醇	1:2	4:1
4	腈苯唑	1:5	2:1
4	甲呋醯胺	1:30	1:4
4	環醯菌胺	1:66	1:12
4	禾草靈	1:100	1:12
4	拌種咯	1:100	1:12
4	苯銹啞	1:50	1:7
4	丁苯嗎啉	1:50	1:7
4	醋酸三苯錫	1:20	1:3
4	三苯錫氣	1:20	1:3
4	氫氧三苯錫	1:20	1:3
4	福美鐵	1:200	1:23
4	嘧菌胺	1:50	1:6
4	氟啞胺	1:25	1:5
4	咯菌腈	1:15	1:2
4	氟醯菌胺	1:20	1:4

化合物	混合配偶體	比例說明(*)	
4	氟嗎啉	1:20	1:3
4	氟吡菌胺	1:7	1:2
4	氟吡菌醯胺	1:20	1:3
4	氟氣菌核利	1:250	1:28
4	氟嘧菌酯	1:10	1:2
4	氟喹唑	1:10	1:2
4	氟哇唑	1:20	1:3
4	磺菌胺	1:100	1:12
4	flutianil	1:10	1:12
4	氟醯胺	1:30	1:4
4	粉唑醇	1:10	1:2
4	滅菌丹	1:100	1:12
4	三乙膦酸鋁	1:200	1:34
4	麥穗靈	1:75	1:9
4	呋霜靈	1:10	1:2
4	福拉比	1:100	1:12
4	雙胍辛鹽	1:100	1:12
4	己唑醇	1:12	1:2
4	惡霉靈	1:500	1:56
4	抑霉唑	1:12	1:2
4	亞胺唑	1:12	1:2
4	iodocarb	1:100	1:12
4	種菌唑	1:12	1:2
4	異稻瘟淨	1:100	1:12
4	異菌尿	1:100	1:12
4	丙森鋅	1:15	1:3
4	稻瘟靈	1:300	1:34
4	isopyrazam	1:15	1:3
4	異噻菌胺	1:15	1:3
4	春雷黴素	1:2	4:1
4	醚菌酯	1:15	1:2
4	代森錳鋅	1:150	1:17
4	雙炔醯菌	1:13	1:2
4	代森錳鋅	1:150	1:17
4	嘧菌胺	1:40	1:7
4	滅銹胺	1:10	1:2
4	meptyldinocap	1:15	1:3
4	苯霜靈	1:10	1:2
4	苯霜靈-M	1:10	1:2

化合物	混合配偶體	比例說明(*)	
4	葉菌唑	1:6	1:2
4	磺菌威	1:100	1:12
4	代森聯	1:100	1:12
4	苯氧菌胺	1:20	1:3
4	苯菌酮	1:13	1:2
4	腈菌唑	1:7	2:1
4	茶替芳	1:100	1:12
4	甲肫鐵銨 (甲基肫酸鐵)	1:100	1:12
4	氟苯嘧啶醇	1:20	1:3
4	辛噻酮	1:100	1:12
4	呋醯胺	1:10	1:2
4	肱醚菌胺	1:20	1:3
4	噁霜靈	1:10	1:2
4	惡喹酸	1:50	1:6
4	噁咪唑	1:12	1:2
4	氧化萎銹靈	1:30	1:4
4	氧四環素	1:25	1:3
4	稻瘟酯	1:100	1:12
4	戊菌唑	1:2	3:1
4	戊菌隆	1:75	1:12
4	吡噻菌胺	1:15	1:3
4	磷酸及鹽	1:100	1:12
4	2-苯并呋喃酮	1:100	1:12
4	啞氧菌酯	1:12	1:2
4	哌丙靈	1:20	1:3
4	多氧黴素	1:25	1:3
4	烯丙苯噻唑	1:20	1:3
4	咪鮮胺	1:50	1:6
4	腐霉利	1:75	1:9
4	霜霉威	1:66	1:12
4	霜霉威-氯化氫	1:66	1:12
4	丙環唑	1:10	1:2
4	甲基代森鋅	1:75	1:12
4	丙氧喹啉	1:5	2:1
4	丙硫菌唑	1:12	1:2
4	唑菌胺酯	1:15	1:2
4	吡嘧磷	1:100	1:12
4	pyribencarb	1:30	1:4
4	啞斑肱	1:20	1:3

化合物	混合配偶體	比例說明(*)	
4	嘧霉胺	1:25	1:4
4	咯嗪酮	1:20	1:3
4	硝吡咯菌素	1:100	1:12
4	滅蟎猛	1:100	1:12
4	苯氧嗪啉	1:7	1:2
4	五氯硝基苯	1:100	1:12
4	矽噻菌胺	1:15	1:2
4	矽氟唑	1:12	1:2
4	螺環菌胺	1:37	1:6
4	鏈黴素	1:25	1:3
4	硫	1:500	1:56
4	戊唑醇	1:12	1:2
4	克枯爛	1:100	1:12
4	四氯硝基苯	1:100	1:12
4	特比萘芬	1:100	1:12
4	氟醚唑	1:12	1:2
4	塞菌靈	1:75	1:9
4	噻呋滅	1:20	1:3
4	苯硫尿酯	1:75	1:9
4	甲基硫菌靈	1:75	1:9
4	福美雙	1:250	1:28
4	噻醯菌胺	1:15	1:3
4	甲基立枯磷	1:250	1:28
4	甲苯氟磺胺	1:100	1:12
4	三唑酮	1:12	1:2
4	三唑醇	1:12	1:2
4	咪唑嗪	1:100	1:12
4	三環唑	1:20	1:3
4	十三嗎啉	1:50	1:7
4	肟菌酯	1:13	1:2
4	三環唑	1:20	1:3
4	噻胺靈	1:20	1:3
4	垂嗎醯胺	1:50	1:6
4	滅菌唑	1:12	1:2
4	烯效唑	1:12	1:2
4	有效黴素	1:20	1:3
4	valiphenal	1:13	1:2
4	乙烯菌核利	1:100	1:12
4	代森鋅	1:250	1:28

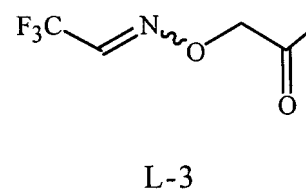
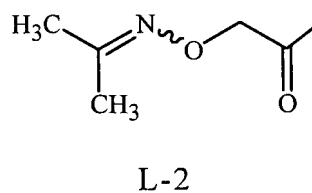
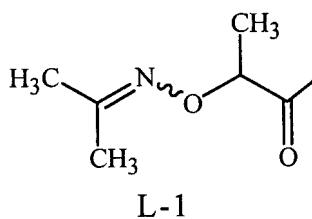
化合物	混合配偶體	比例說明(*)	
4	福美銻	1:250	1:28
4	苯醯菌胺	1:13	1:2
4	3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-3-異噁唑 烷基]吡啶	1:20	1:3
4	4-氯苯基 <i>N</i> -[1-[[[1-(4-氯基苯基)乙 基]磺醯基]甲基]丙基]胺基甲酸酯	1:13	1:2
4	5-氯-6-(2,4,6-三氟苯基)-7-(4-甲基哌 啶-1-基)[1,2,4]三唑[1,5- <i>a</i>]嘧啶	1:10	1:2
4	α -[甲氧基亞胺基]- <i>N</i> -甲基 -2-[[[1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基]亞 胺基]甲基]苯乙醯胺	1:20	1:3
4	<i>N</i> -(4-氯-2-硝基苯基)- <i>N</i> -乙基-4-甲基 苯磺醯胺	1:20	1:3
4	<i>N</i> -[[[環丙基甲氧基]胺基][6-(二氟甲 氧基)-2,3-二氟苯基]-亞甲基]苯乙醯 胺	1:2	4:1
4	<i>N</i> -[2-(1,3-二甲基丁基)苯基]-5-氟 -1,3-二甲基-1 <i>H</i> -吡唑-4-甲醯胺	1:15	1:3
4	<i>N</i> -[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基] 氧]-3-甲氧基]乙基]-3-甲基-2-[(乙 磺醯基)胺基]丁醯胺	1:13	1:2
4	<i>N</i> -[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基] 氧]-3-甲氧基]乙基]-3-甲基-2-[(甲 磺醯基)胺基]丁醯胺	1:13	1:2
4	<i>N</i> -[4-[4-氯-3-(三氟甲基)苯氧基]-2,5- 二甲基苯基]- <i>N</i> -乙基- <i>N</i> -甲基甲脒	1:20	1:3

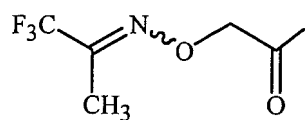
本揭露亦包括表 A2 至 A7，各表如同表 A1 建構除了行頭「化合物」下的條目用下列所示的化合物代號取代（見索引表 A-B 的化合物描述）。因此，表 A2 與表 A1 相同，除了行頭「化合物」下的各「4」條目用「2」取代。表 A3 至 A7 以類似表 A2 的方式建構。

表號	化合物
A2	2
A3	18
A4	20
A5	42
A6	43
A7	44

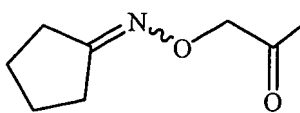
下面的測試論證了本發明化合物對具體病原體的控制功效。然而，由所述化合物提供的病原體控制保護不限於這些物種。對於化合物描述，請參見索引表 A-B。對於 ^1H NMR 資料，請參見表 C。在索引表 A-B 中，縮寫「化合物 No.」指「化合物」，縮寫「Ex.」代表「實例」並且其後面的數字指明化合物是在哪個實例中製備。AP⁺ (M+1) 列所報告的數值為將 H⁺ (分子量 1) 加至具有最高同位素豐度 (即 M) 分子所形成的觀測分子離子的分子量。含有一或多個較高原子量但具有較低豐度的同位素 (如 ^{37}C 、 ^{81}C) 的分子離子其存在並未報告。所報告的 M+1 峰是利用大氣壓化學電離 (AP⁺) 通過質譜來觀察。在表 A-B 上方的馬庫斯結構所示的 L 取代基代表 (R¹)(R²)=N~AC(R³)(R⁴)C(=W)- 部分，其示出於本發明概述中的式 1。在表 A-B 中行頭「L」下為選自 L-1 至 L-30 的條目。例如，用於化合物代號 1 的 L 為 L-1，用於化合物代號 7 的 L 為 L-2，而用於化合物代號 12 的 L 為 L-8。L-1 至 L-30 的結構如下所示。

向右伸出的鍵連接至吡啶的氮原子上，如在表 A 與 B 上方的馬庫斯結構所示。

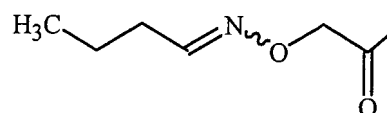




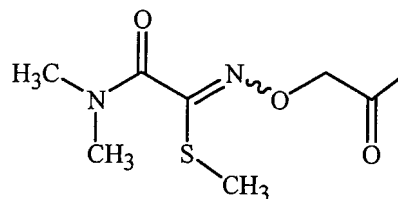
L-4



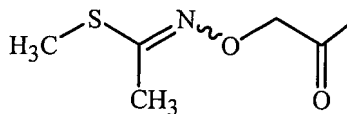
L-5



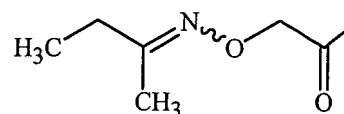
L-6



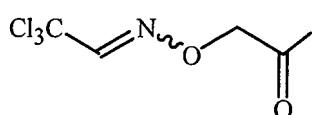
L-7



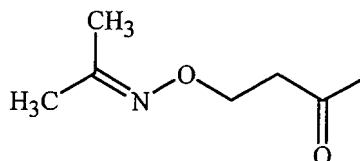
L-8



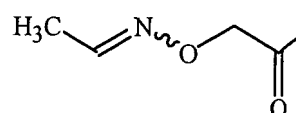
L-9



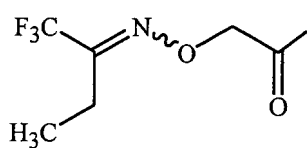
L-10



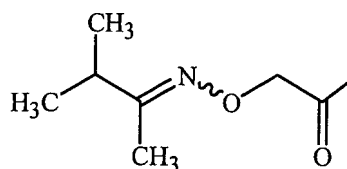
L-11



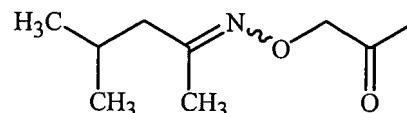
L-12



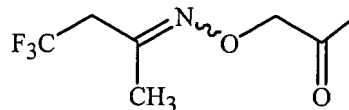
L-13



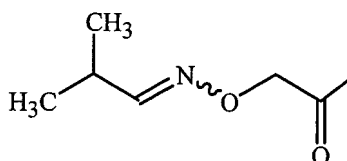
L-14



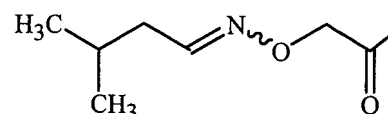
L-15



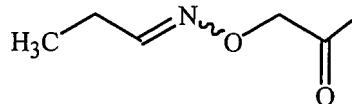
L-16



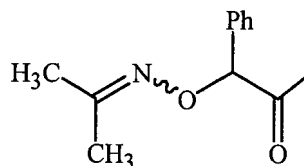
L-17



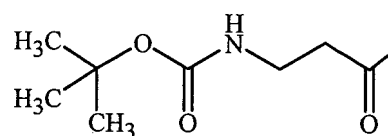
L-18



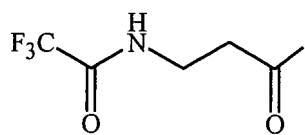
L-19



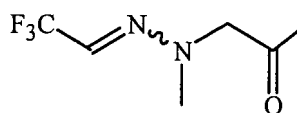
L-20



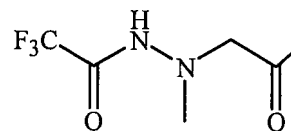
L-21



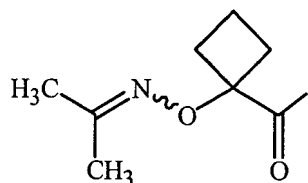
L-22



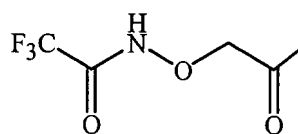
L-23



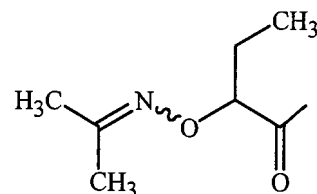
L-24



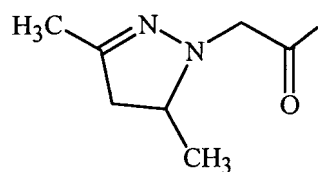
L-25



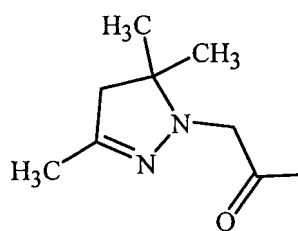
L-26



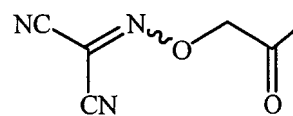
L-27



L-28

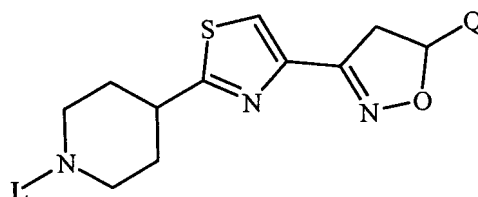


L-29

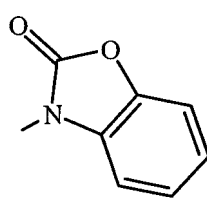
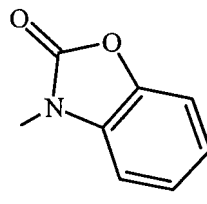


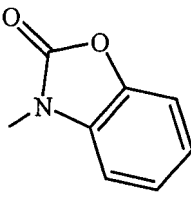
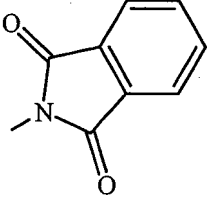
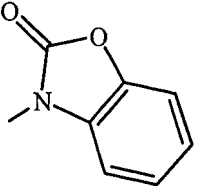
L-30

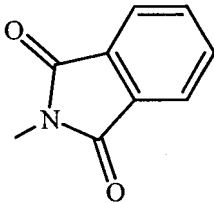
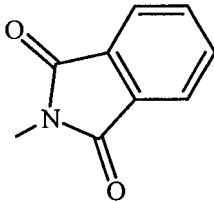
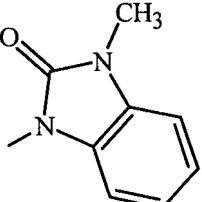
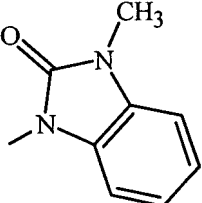
索引表 A



化合物

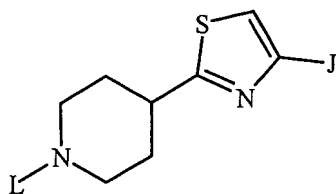
No.	L	Q	AP ⁺ (M+1)
1	L-1	2,6-二氟苯基	447
2	L-2	2,6-二氟苯基	463
3	L-3	2,6-二氟苯基	503
4	L-4	2,6-二氟苯基	517
5	L-5	2,6-二氟苯基	489
6	L-2	苯基	427
7	L-2	2-氟苯基	445
8	L-2		484
9	L-1		498
10	L-6	2,6-二氟苯基	477
11	L-7	2,6-二氟苯基	552
12	L-8	2,6-二氟苯基	495
14	L-2	2-甲基苯基	441
16	L-9	2,6-二氟苯基	477
17	L-10	2,6-二氟苯基	551

化合物 No.	L	Q	AP ⁺ (M+1)
18	L-3		524
19	L-3		536
20	L-3	2-氟基苯基	492
21	L-11	2,6-二氟苯基	477
22	L-12	2,6-二氟苯基	449
23	L-13	2,6-二氟苯基	532
24	L-14	2,6-二氟苯基	492
25	L-15	2,6-二氟苯基	506
26	L-16	2,6-二氟苯基	531
27	L-17	2,6-二氟苯基	478
28	L-18	2,6-二氟苯基	491
30	L-19	2,6-二氟苯基	463
32	L-20	2,6-二氟苯基	*
33	L-21	2,6-二氟苯基	521
34	L-22	2,6-二氟苯基	517
35	L-23	2,6-二氟苯基	516
36	L-24	2,6-二氟苯基	532
37	L-25	2,6-二氟苯基	503
38	L-26	2,6-二氟苯基	519
39	L-27	2,6-二氟苯基	491
40	L-28	2,6-二氟苯基	488
41	L-2	2-氟基苯基	452
42	L-4	2-氟基苯基	506
43	L-4		538

化合物 No.	L	Q	AP ⁺ (M+1)
44	L-4		550
45	L-2		496
46	L-29	2,6-二氟苯基	502
48	L-3		537
49	L-4		551
51	L-30	2,6-二氟苯基	485

¹H NMR 資料見表 C。

索引表 B



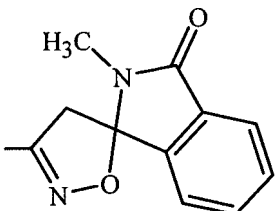
J 為藉由向左伸出的鍵連接至上述式之噻唑環。

化合物

No.	L	J	AP ⁺ (M+1)
13	L-2		453
15	L-2		443
29	L-3		493
31	L-3		483
47	L-3		522

J 為藉由向左伸出的鍵連接至上述式之噻唑環。

化合物

No.	L	J	AP ⁺ (M+1)
50	L-4		536

[註 1]: R-異構物。

索引表 C

化合物 No. ¹H NMR 數據 (CDCl₃ 溶液, 除非另有說明) ^a

32 δ 7.60 (d, 1H), 7.43 (d, 2H), 7.27–7.36–7.27 (m, 4H), 6.89 (t, 2H), 6.04 (t, 1H), 5.90 (d, 1H), 4.65 (t, 1H), 4.02–4.07–4.02 (m, 2H), 3.75 (t, 1H), 3.54–3.61–3.54 (m, 1H), 3.19 (br s, 1H), 3.02 (q, 1H), 2.81 (q, 1H), 2.12 (d, 1H), 1.96 (s, 3H), 1.88 (s, 3H), 1.52–1.80–1.52 (m, 2H).

a ¹H NMR 數據是以相對於四甲基矽烷向低場偏移的 ppm 計。耦合通過 (s)-單峰、(d)-雙重峰、(t)-三重峰、(m)-多重峰、(q)-四重峰以及 (br s)-寬單峰指明。

本發明的生物學實例

製備用於測試 A-B2 的試驗懸浮劑的一般方案：首先將試驗化合物以等於最終體積的 3% 的量溶解於丙酮中，然後將其以所需濃度（單位為 ppm）懸浮於含有 250 ppm 表面活性劑 Trem® 014（多元醇酯）的丙酮和純化水（50/50 體積混合物）中。然後將所得試驗懸浮劑用於測試 A-B2。在試驗植物上噴灑 200 ppm 試驗懸浮劑至流失點等同於 800 g/ha 的比率。

測試 A

將葡萄籽苗用葡萄生單軸霉的孢子懸浮液（葡萄霜霉病致病原）進行接種，並在 20 °C 下於飽和大氣中孵育 24 小時。在短的乾燥期後，用試驗懸浮劑噴灑葡萄籽苗至流失點、然後將其移至 20 °C 的生長箱 5 天，之後放回 20 °C 的飽和大氣中 24 小時。移出後，進行病害等級目視評定。

測試 B1

將試驗懸浮劑噴灑在番茄籽苗上至流失點。第二天，將籽苗用致病疫霉的孢子懸浮液（番茄晚疫病致病原）進行接種，並在 20 °C 的飽和大氣中孵育 24 小時，然後將其移至 20 °C 的生長箱 5 天，之後進行病害等級目視評定。

測試 B2

將番茄籽苗用致病疫霉的孢子懸浮液（番茄晚疫病致病原）進行接種，並在 20 °C 下於飽和大氣中孵育 17 小時。在短的乾燥期後，用試驗懸浮液噴灑番茄籽苗至流失點，然後將其移至 20 °C 的生長箱 4 天，之後進行病害等級目視評定。

測試 A-B2 的結果在表 A 中給出。在表中，等級 100 表示 100% 疾病控制，而等級 0 表示無疾病控制（相對於對照而言）。所有結果都是針對 10 ppm 而言，後面有表示 40 ppm 的「*」和表示 200 ppm 的「**」除外。

表 A

<u>化合物 No.</u>	<u>測試 A</u>	<u>測試 B1</u>	<u>測試 B2</u>
1	100	100	99
2	100	100	100
3	100	100	99
4	100	100	99
5	95	95	98
6	98	90	90
7	100	100	98
8	100	99	99
9	100	100	97
10	98	95	88
11	0	26	0
12	17	47	0
13	99	99	99
14	100	98	88
15	99*	39*	91*
16	100	100	99
17	66	97	47
18	100	100	98
19	99	100	94
20	100	100	99
21	100*	100*	98*
22	100	100	99
23	98	99	83
24	95*	100*	96*
25	93*	100*	58*
26	100	100	99
27	98*	100*	99*
28	98*	95*	68*
29	100	100	99
30	100*	100*	99*
31	100*	100*	99*
32	94*	100*	92*
33	0**	68**	0**

34	33**	97**	40**
35	100*	100*	99*
36	60**	100**	93**
37	75*	84*	0*
38	99*	100*	99*
39	100*	100*	99*
40	97*	100*	99*
41	100	100	99
42	100	100	99
43	100	100	99
44	100	100	99
45	96	95	99
46	9*	90*	81*
47	100	100	99
48	100	100	99
49	100	100	99
50	100	100	99
51	99	100	99

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號： 98141182

C07D 417/04

※申請日： 98.12.2

※IPC 分類： C07D 417/14

一、發明名稱：(中文/英文)

A01N 43/78

殺真菌雜環化合物

A01N 43/40

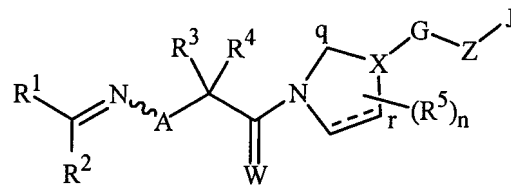
FUNGICIDAL HETEROCYCLIC COMPOUNDS

A01P 3/00

(200901)

二、中文發明摘要：

本發明公開了式 1 化合物，包括其所有幾何和立體異構體、互變異構體、*N*-氧化物以及其鹽，



1

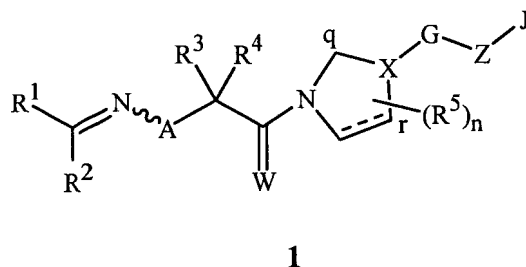
其中

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、A、W、X、G、Z、J 和 n 是如本公開中所定義。

本發明還公開了含有所述式 1 化合物的組合物和用於控制由真菌病原體引起的植物病害的方法，所述方法包括施用有效量的本發明化合物或組合物。

三、英文發明摘要：

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



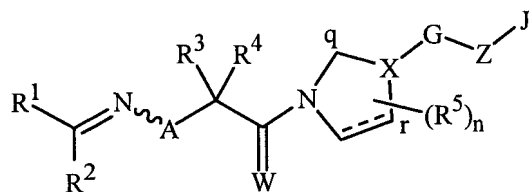
wherein

R¹, R², R³, R⁴, R⁵, A, W, X, G, Z, J and n are as defined in the disclosure.

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

七、申請專利範圍：

1. 一種選自式 1 的化合物、其互變異構體、*N*-氧化物和其鹽，



1

5

其中

A 為 -O-、-S-、-N(R⁷)-、-C(R⁸)₂-、-OC(R⁸)₂-、-SC(R⁸)₂-
或 -N(R⁷)C(R⁸)₂-，

其中向左伸出的鍵連接至式 1 的氮原子，而向右伸出的
鍵連接至式 1 的碳原子；

10

W 為 O 或 S；

G 為經任選取代的 5 員雜環；

Z 為直接鍵、O、C(=O)、S(=O)_m、CH(R¹²)或 N(R¹³)；

J 是 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環
系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個
雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、
最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其
中最多 3 個碳原子環員獨立選自 C(=O)和 C(=S)，
所述硫原子環員獨立選自 S(=O)_s(=NR¹¹)_f，而所述
矽原子環員獨立選自 SiR⁹R¹⁰，每個環或環系統任
選經最多 5 個獨立選自 R⁶ 的取代基取代；或者

15

20

當 Z 為直接鍵時，則 J 也為 C(=W²)NT^AT^B；

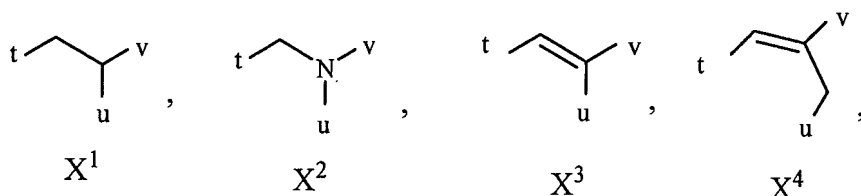
W^2 為 O 或 S ;

T^A 為 H 或 C_1 - C_3 烷基 ;

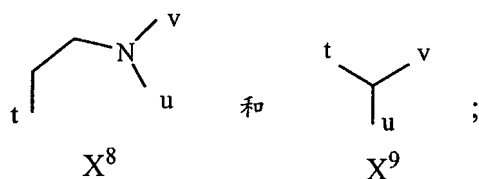
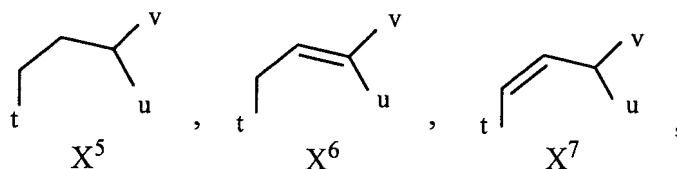
T^B 為 $CR^{14}R^{15}R^{16}$;

X 為選自如下的基團 :

5



O



10

O

其中 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 X^7 、 X^8 或 X^9 的用「t」標識的鍵連接至式 1 的用「q」標識的碳原子，用「u」標識的鍵連接至式 1 的用「r」標識的碳原子，而用「v」標識的鍵則連接至式 1 的 G；

15

R^1 為 H、鹵素、氰基、胺基、-CHO、-C(=O)OH、-C(=O)NH₂、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、 C_4 - C_6 烷基環烷基、 C_4 - C_6 環烷基烷基、 C_4 - C_6 鹵環烷基烷基、 C_3 - C_6 環烯基、

20

C_3-C_6 鹵環烯基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 C_2-C_6 烷硫基
 烷基、 C_2-C_6 烷基亞磺醯基烷基、 C_2-C_6 烷基磺醯
 基烷基、 C_2-C_6 烷基胺基烷基、 C_3-C_6 二烷基胺基
 烷基、 C_2-C_6 鹵烷基胺基烷基、 C_2-C_6 烷基羰基、
 5 C_2-C_6 鹵烷基羰基、 C_4-C_6 環烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧
 基羰基、 C_4-C_6 環烷氧基羰基、 C_5-C_6 環烷基烷氧
 基羰基、 C_2-C_6 烷基胺基羰基、 C_3-C_6 二烷基胺基
 羰基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_3-C_6 環烷
 氧基、 C_3-C_6 鹵環烷氧基、 C_2-C_6 烯氧基、 C_2-C_6
 10 鹵烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_3-C_6 鹵炔氧基、 C_2-C_6
 烷氧基烷氧基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 鹵烷
 基羰基氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 鹵烷硫基、 C_3-C_6
 環烷硫基、 C_1-C_6 烷基胺基、 C_2-C_6 二烷基胺基、
 C_1-C_6 鹵烷基胺基、 C_2-C_6 鹵二烷基胺基、 C_3-C_6
 15 環烷基胺基、 C_2-C_6 烷基羰基胺基、 C_2-C_6 鹵烷基
 羰基胺基、 C_1-C_6 烷基磺醯基胺基或 C_1-C_6 鹵烷基
 磺醯基胺基；

R^2 是 H、鹵素、氰基、羥基、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷
 基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 烷氧基或 C_1-C_3 烷硫基；
 20 或

R^1 和 R^2 與它們連接的碳原子一起形成 3-至 7-員環，所
 述環含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，
 所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、
 最多 2 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳
 25 原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，所述硫原子環
 員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而所述矽原子環員獨

立選自 $\text{SiR}^9\text{R}^{10}$ ，所述環任選經最多 4 個獨立選自
 碳原子環員上的鹵素、氰基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$
 鹵烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷氧基和 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 鹵烷氧基和氮原子
 環員上的氰基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基和 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷氧基的取代
 基取代；

R^3 為經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選
 取代的 5-至 6-員雜芳環；或 H、鹵素、氰基、羥
 基、 $-\text{CHO}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 炔基、
 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 鹵烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 鹵炔基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$
 烷氧基烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷硫基烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基亞磺
 醯基烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基磺醯基烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基羰
 基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 鹵烷基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_5$ 烷氧基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_5$
 烷基胺基羰基、 $\text{C}_3\text{-C}_5$ 二烷基胺基羰基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷
 氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷硫基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷
 硫基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基亞磺醯基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基亞磺醯
 基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基磺醯基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基磺醯基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$
 烷基羰基氧基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 鹵烷基羰基氧基、 $\text{C}_2\text{-C}_5$ 烷
 氧基羰基氧基、 $\text{C}_2\text{-C}_5$ 烷基胺基羰基氧基或 $\text{C}_3\text{-C}_5$
 二烷基胺基羰基氧基；

R^4 為 H、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ 烷基或 $\text{C}_1\text{-C}_3$ 鹵烷基；

R^3 和 R^4 與它們連接的碳原子一起形成 3-至 6-員飽和碳
 環；

每個 R^5 獨立地是鹵素、氰基、羥基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$
 烯基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基或 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基；或者

兩個 R^5 基團合在一起為 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 伸烷基或 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 伸烯基，
 以形成橋聯雙環系統或稠合的雙環系統；或者

與由雙鍵接合的相鄰環碳原子連接的兩個 R^5 基團合在一起為 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ ，該 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ 任選經最多 3 個獨立選自鹵素、氰基、羥基、胺基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 鹵烷氧基的取代基取代；

每個 R^6 獨立地為 H、鹵素、氰基、羥基、胺基、硝基、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ 、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵炔基、 C_3-C_8 環烷基、 C_3-C_8 鹵環烷基、 C_4-C_{10} 烷基環烷基、 C_4-C_{10} 環烷基烷基、 C_6-C_{14} 環烷基環烷基、 C_4-C_{10} 鹵環烷基烷基、 C_5-C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_3-C_8 環烯基、 C_3-C_8 鹵環烯基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 C_4-C_{10} 環烷氧基烷基、 C_3-C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2-C_6 烷硫基烷基、 C_2-C_6 烷基亞磺醯基烷基、 C_2-C_6 烷基磺醯基烷基、 C_2-C_6 烷基胺基烷基、 C_3-C_8 二烷基胺基烷基、 C_2-C_6 鹵烷基胺基烷基、 C_4-C_{10} 環烷基胺基烷基、 C_2-C_6 烷基羰基、 C_2-C_6 鹵烷基羰基、 C_4-C_8 環烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_4-C_8 環烷氧基羰基、 C_5-C_{10} 環烷基烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基胺基羰基、 C_3-C_8 二烷基胺基羰基、 C_4-C_8 環烷基胺基羰基、 C_2-C_6 鹵烷氧基烷基、 C_1-C_6 羥烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_3-C_8 環烷氧基、 C_3-C_8 鹵環烷氧基、 C_4-C_{10} 環烷基烷氧基、 C_2-C_6 烯氧基、 C_2-C_6 鹵烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_2-C_6 鹵炔氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷氧基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 鹵烷基羰

基氧基、 C_4-C_8 環烷基羰基氧基、 C_3-C_6 烷基羰基
 烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 鹵烷硫基、 C_3-C_8
 環烷硫基、 C_1-C_6 烷基亞磺基、 C_1-C_6 鹵烷基亞
 磺基、 C_1-C_6 烷基磺基、 C_1-C_6 鹵烷基磺基、
 5 C_3-C_8 環烷基磺基、 C_3-C_{10} 三烷基矽烷基、 C_1-C_6
 烷基磺基胺基、 C_1-C_6 鹵烷基磺基胺基、
 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；

每個 Z^2 獨立地是直接鍵、O、 $C(=O)$ 、 $S(O)_m$ 、 $CH(R^{12})$
 或 $N(R^{13})$ ；

10 每個 Q 獨立地為苯基、苄基、萘基、5-至 6-員雜芳環
 或 8-至 11-員雜芳族雙環系統，各任選任選經最多
 2 個獨立選自碳和氮原子環員上的 R^{6b} 的取代基
 取代，並且各任選經最多 5 個獨立選自碳原子環
 員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3
 15 烷基羰基、 C_2-C_3 烷氧基羰基或 C_1-C_3 烷氧基的取
 代基取代；或者

3-至 7-員非芳族碳環、5-至 7-員非芳族雜環或 8-至 11-
 員非芳族雙環系統，每個環或環系統含有選自碳
 原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立
 選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最
 20 多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選
 自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，所述硫原子環員獨立選自
 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而所述矽原子環員獨立選自
 SiR^9R^{10} ，每個環或環系統的碳和氮原子環員任選
 25 經最多 2 個獨立選自 R^{6b} 的取代基取代，最多 5
 個獨立選自碳原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上

的 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 烷氧基羰基和 C_1-C_3 烷氧基的取代基；

每個 R^{6a} 獨立地是鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、
5 C_4-C_{10} 環烷基烷基、 C_4-C_{10} 烷基環烷基、 C_5-C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_6-C_{14} 環烷基環烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵炔基、 C_3-C_6 鹵環烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 鹵烷硫基、 C_1-C_4 烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 烷基磺醯基、 C_1-C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 鹵烷基磺醯基、 C_1-C_4 烷基胺基、 C_2-C_8 二烷基胺基、 C_3-C_6 環烷基胺基、 C_2-C_4 烷氧基烷基、 C_1-C_4 羥烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 烷基羰基硫基、 C_2-C_6 烷基胺基羰基、
10 C_3-C_8 二烷基胺基羰基或 C_3-C_6 三烷基矽烷基；或
 R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成 5-至 7-員環，所述環含有選自碳原子和任選最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，所述環任選經最多 3 個取代基獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

每個 R^{6b} 獨立地為任選經最多 3 個獨立選自如下的取代基取代的苯基：鹵素、氰基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基；或
25

5-至 6-員雜芳環，所述雜芳環含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 4 個 N 原子，該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、
5 氰基、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₁-C₂ 烷氧基和 C₁-C₂ 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 烷氧基的取代基取代；或

3-至 7-員非芳族環，所述環含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 4 個 N 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 C(=O)和 C(=S)，所述環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、
10 氰基、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₁-C₂ 烷氧基和 C₁-C₂ 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 烷氧基的取代基取代；

R⁷ 是 H、氰基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 鹵烷基、C₂-C₄ 烷氧基烷基、C₂-C₄ 烷硫基烷基、C₂-C₄ 烷基羰基、C₂-C₄ 鹵烷基羰基、C₂-C₄ 烷氧基羰基、C₂-C₄ 烷基胺基羰基、C₃-C₅ 二烷基胺基羰基、C₁-C₄ 烷基磺醯基
20 或 C₁-C₄ 鹵烷基磺醯基；或者

R² 和 R⁷ 與它們連接的連接原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環，除了所述連接原子外，所述環還含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個
25 N 原子，所述環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂

鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

每個 R^8 獨立地為 H、 C_1-C_3 烷基或 C_1-C_3 鹵烷基；

5 每個 R^9 和 R^{10} 獨立地為 C_1-C_5 烷基、 C_2-C_5 烯基、 C_2-C_5 炔基、 C_3-C_5 環烷基、 C_3-C_6 鹵環烷基、 C_4-C_{10} 環烷基烷基、 C_4-C_7 烷基環烷基、 C_5-C_7 烷基環烷基烷基、 C_1-C_5 鹵烷基、 C_1-C_5 烷氧基或 C_1-C_5 鹵烷氧基；

10 每個 R^{11} 獨立地是 H、氰基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_3-C_8 環烷基、 C_3-C_8 鹵環烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_1-C_6 烷基胺基、 C_2-C_8 二烷基胺基、 C_1-C_6 鹵烷基胺基或苯基；

每個 R^{12} 獨立地是 H、 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 鹵烷基；

15 每個 R^{13} 獨立地是 H、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_3-C_6 環烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 鹵烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基或 C_2-C_4 鹵烷氧基羰基；

R^{14} 為 H 或 C_1-C_4 烷基；

20 R^{15} 為苯基、苜基、萘基或 5-至 6-員雜芳環，各在環員上任選經最多 3 個獨立選自 R^{19} 的取代基取代；

R^{16} 為 H、氰基、硝基、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基或 C_2-C_6 炔基；

25 每個 R^{17} 獨立地是 H、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_3-C_8 環烷基、 C_2-C_6 烷基羰基、 C_2-C_6 鹵烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基或 C_2-C_6 鹵烷氧基羰基；

每個 R^{18} 獨立地為 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_3-C_8 環烷基、 C_2-C_6 烷基羰基、 C_2-C_6 鹵烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 鹵烷氧基羰基或 $-Z^3Q$ ；

每個 R^{19} 獨立地為鹵素、氰基、羥基、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基或 C_1-C_3 烷氧基；或者

R^{16} 和 R^{19} 與它們連接的原子一起形成 3-至 7-員環，所述環含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 2 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 2 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，所述硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而所述矽原子環員獨立選自 SiR^9R^{10} ，所述環任選經最多 4 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、羥基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

每個 Z^3 獨立地為 O、 $C(=O)$ 、 $S(O)_m$ 或 $CH(R^{12})$ ；

每個 m 獨立地為 0、1 或 2；

n 為 0、1 或 2；並且

s 和 f 在每種 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ 的情況下都獨立地為 0、1 或 2，前提條件是 s 與 f 之和為 0、1 或 2。

2. 根據申請專利範圍第 1 項所述之化合物，其中：

A 為 $-O-$ 、 $-S-$ 或 $-N(R^7)-$ ；

G 為 5-員雜環，其任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的 R^{26} 和氮原子環員上的 R^{27} 的取代基取代；

每個 R^{26} 獨立地為鹵素、 C_1-C_3 烷基或 C_1-C_3 鹵烷基；

每個 R^{27} 獨立地為 C_1 - C_3 烷基；

Z 為直接鍵、 $CH(R^{12})$ 或 $N(R^{13})$ ；

J 為 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 4 個 N，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，而所述硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，每個環或環系統任選經最多 5 個獨立選自 R^6 的取代基取代；或者當 Z 為直接鍵時，J 也為 $C(=W^2)NT^A T^B$ ；

X 為 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 X^7 或 X^8 ；

R^1 為 H、氰基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 鹵烯基、 C_2 - C_4 鹵炔基、 C_2 - C_4 烷氧基烷基、 C_2 - C_4 烷硫基烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_4 烯氧基、 C_2 - C_4 鹵烯氧基、 C_2 - C_4 炔氧基、 C_3 - C_4 鹵炔氧基、 C_2 - C_4 烷氧基烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 烷基胺基、 C_2 - C_4 二烷基胺基、 C_1 - C_4 鹵烷基胺基或 C_2 - C_4 鹵二烷基胺基；

R^2 為 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 烷氧基或 C_1 - C_3 鹵烷基；或者

R^1 和 R^2 與它們連接的碳原子一起形成 3-至 6-員環，所述環含有選自碳原子和最多 2 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 2 個 N，其中最多 1 個碳原子環員為 $C(=O)$ 或 $C(=S)$

而所述環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的
 鹵素、氰基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷
 氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、
 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

5 R^3 為經任選取代的苯基或經任選取代的萘基或經任選
 取代的 5-至 6-員雜芳環；或 H、氰基、羥基、 C_1-C_3
 烷基、 C_2-C_3 烯基、 C_2-C_3 炔基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_2-C_3
 鹵烯基、 C_2-C_3 鹵炔基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 鹵
 烷羰基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3
 10 烷硫基、 C_1-C_3 鹵烷硫基、 C_2-C_3 烷基羰基氧基或
 C_2-C_3 鹵烷基羰基氧基；

R^4 為 H 或 C_1-C_2 烷基；

每個 R^5 獨立地為鹵素、氰基、羥基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_2
 鹵烷基或 C_1-C_2 烷氧基；

15 R^6 獨立地為 H、鹵素、氰基、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、
 C_2-C_6 炔基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵
 炔基、 C_3-C_8 環烷基、 C_3-C_8 鹵環烷基、 C_4-C_{10} 烷基
 環烷基、 C_4-C_{10} 環烷基烷基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、
 20 C_4-C_{10} 環烷氧基烷基、 C_3-C_8 烷氧基烷氧基烷基、
 C_2-C_6 烷硫基烷基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_1-C_6 烷氧
 基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_3-C_8 環烷氧基、 C_3-C_8 鹵環
 烷氧基、 C_4-C_{10} 環烷基烷氧基、 C_2-C_6 烯氧基、 C_2-C_6
 鹵烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_2-C_6 鹵炔氧基、 C_2-C_6
 烷氧基烷氧基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 鹵烷基
 25 羰基氧基、 C_4-C_8 環烷基羰基氧基、 C_3-C_6 烷基羰基

烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 鹵烷硫基、 C_3-C_8 環
 烷硫基、 C_3-C_{10} 三烷基矽烷基、 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；

每個 Z^2 獨立地為直接鍵、 O 、 $C(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 或 $CH(R_{12})$ ；

每個 Q 獨立地為苯基、苄基、萘基、5-至 6-員雜芳環或

5 8-至 11-員雜芳族雙環系統，各任選經最多 1 個選
 自碳和氮原子環員上的 R^{6b} 的取代基取代，最多 5
 個獨立選自碳原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的
 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 烷氧基羰基或
 C_1-C_3 烷氧基的取代基；或

10 3-至 7-員非芳族碳環、5-至 7-員非芳族雜環或 8-至
 11-員非芳族雙環系統，每個環或環系統含有選自碳
 原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選
 自最多 2 個 O 、最多 2 個 S 、最多 4 個 N 和最多 2
 個 Si 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$
 15 和 $C(=S)$ ，所述硫原子環員獨立選自
 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而所述矽原子環員獨立選自
 SiR^9R^{10} ，每個環或環系統任選經最多 1 個選自碳和
 氮原子環員上的 R^{6b} 的取代基取代，最多 5 個獨立
 選自碳原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的 C_1-C_3
 20 烷基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 烷氧基羰基和 C_1-C_3
 烷氧基的取代基；

每個 R^{6a} 獨立地為鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1-C_3
 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基或 C_1-C_3 鹵烷氧
 基；或者

25 R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成 5-至 6-員環，所述
 環含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述

雜原子選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，所述環任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基和氮原子環員上的 C_1-C_2 烷基的取代基取代；

5 R^7 為 H、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 $CH_3C(=O)$ 、 $CF_3C(=O)$ 或 $CH_3OC(=O)$ ；或者

R^2 和 R^7 與它們連接的相連原子一起形成 5-至 7-員部分飽和環，除所述相連原子外，所述環還含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，所述環任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

10 每個 R^{13} 獨立為 H、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烷基羰基或 C_2-C_3 烷氧基羰基；

每個 R^{18} 獨立地為 C_1-C_3 烷基或 $-Z^3Q$ ；並且

每個 Z^3 獨立地為 $C(=O)$ 或 $S(=O)_2$ 。

20

3. 根據申請專利範圍第 2 項所述之化合物，其中：

A 為 $-O-$ 或 $-N(R^7)-$ ；

G 為示例 2 中示出的 G-1 至 G-59 中的一者，其中向左伸出的鍵連接至 X，而向右伸出的鍵連接至式 1 中的 Z；

25

每個 R^{26a} 獨立選自 H 和 R^{26} ；

R^{27a} 選自 H 和 R^{27} ;

Z 為直接鍵 ;

J 為示例 3 中示出的 J-1 至 J-82 中的一者，其中該浮動
 鍵透過所述環或環系統中的可用碳或氮原子環員
 5 連接至式 1 中的 Z ;

X 為 1 至 5 的整數 ;

當 X 為 2、3、4 或 5 的整數時，則最多一 R^6 的例子
 為 $-Z^2Q$; 或者

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$;

10 W^2 為 O ;

X 為 X^1 、 X^2 或 X^3 ;

R^1 為 H、氰基、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烯基、 C_2-C_3 炔基、
 C_1-C_3 鹵烷基、 C_2-C_3 鹵烯基、 C_2-C_3 鹵炔基、 C_1-C_3
 烷氧基或 C_1-C_3 鹵烷氧基 ;

15 R^2H 、 C_1-C_3 烷基或 C_1-C_3 鹵烷基 ;

R^3 為苯基、萘基或 5-或 6-員雜芳環，每個環或環系統
 任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的 R^{25a} 和氮
 原子環員上的 R^{25b} 的取代基取代；或 H、氰基、羥
 基、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烯基、 C_2-C_3 炔基、 C_1-C_3 鹵
 20 烷基、 C_2-C_3 鹵烯基、 C_2-C_3 鹵炔基、 C_2-C_3 烷基羰
 基、 C_2-C_3 鹵烷基羰基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷
 氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 鹵烷硫基、 C_2-C_3 烷基
 羰基氧基或 C_2-C_3 鹵烷基羰基氧基 ;

每個 R^{25a} 獨立地為鹵素、氰基、羥基、胺基、硝基、 C_1-C_6
 25 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_4-C_{10}
 環烷基烷基、 C_4-C_{10} 烷基環烷基、 C_5-C_{10} 烷基環烷

基烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵炔基、 C_3-C_6 鹵環烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 烷基磺醯基、 C_1-C_4 鹵烷硫基、 C_1-C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 鹵烷基磺醯基、 C_1-C_4 烷基胺基、 C_2-C_8 二烷基胺基、 C_3-C_6 環烷基胺基、 C_2-C_4 烷氧基烷基、 C_1-C_4 羥烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 烷基羰基硫基、 C_2-C_6 烷基胺基羰基、 C_3-C_8 二烷基胺基羰基或 C_3-C_6 三烷基矽烷基；

每個 R^{25b} 獨立地為 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_3-C_6 鹵烯基、 C_3-C_6 鹵炔基、 C_3-C_6 鹵環烷基或 C_2-C_4 烷氧基烷基；

每個 R^5 獨立地為氰基、甲基或甲氧基；

每個 R^6 獨立地為 H、氰基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_3-C_8 環烷基、 C_3-C_8 鹵環烷基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_3-C_8 環烷氧基、 C_2-C_6 烯氧基、 C_2-C_6 鹵烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷氧基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 鹵烷基羰基氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 鹵烷硫基、 C_3-C_{10} 三烷基矽烷基、 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；

每個 Z^2 為直接鍵；

Q 為示例 5 中示出的 Q-1 至 Q-102 中的一者，其中向左伸出的鍵連結至式 1 中的 Z^2 ；

每個 R^{6c} 獨立選自 H、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 烷氧基羰基和 C_1-C_3 烷氧基；

p 為 0 至 5 的整數

g 為 0 至 1 的整數

每個 R^{6a} 獨立地為鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基；或

R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成經任選取代的 5-至 6-員環，所述環含有選自碳原子和最多 1 個雜原子的環員，所述雜原子選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，所述環的碳原子環員任選經最多 1 個獨立選自鹵素、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基的取代基取代；

R^7 為 H 或 C_1 - C_2 烷基；或

R^2 和 R^7 與它們連接的相連原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環，除所述相連原子外，所述環還含有選自碳的環員，所述環任選經最多 2 個獨立選自 C_1 - C_2 烷基，

每個 R^{18} 獨立地為 C_1 - C_3 烷基；並且

n 為 0 或 1。

4. 根據申請專利範圍第 3 項所述之化合物，其中：

W 為 O；

G 選自 G-1、G-2、G-7、G-8、G-14、G-15、G-23、G-24、G-26、G-27、G-36、G-37、G-38、G-49、G-50 和 G-55；

x 為 1、2 或 3；

J 選自 J-1、J-2、J-3、J-4、J-5、J-7、J-8、J-9、J-10、
J-11、J-12、J-14、J-15、J-16、J-20、J-24、J-25、
J-26、J-29、J-30、J-37、J-38、J-45 和 J-69；或

J 為示例 4 中示出的 J-83 至 J-91 中的一者，其中向左伸
出的鍵連接至 X，而向右伸出的鍵連接至式 1 中的
G，用星號(*)標識的碳原子具有立構中心；

每個 R^6 獨立地為 H、氟基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、
 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基、 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；

每個 R^{28a} 獨立選自鹵素、羥基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷
氧基並且連接至碳環員；

R^{28b} 選自鹵素、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基；

每個 j 和 p 獨立地為 0、1 或 2；

X 為 X^1 或 X^2 ；

R^1 為 H、 C_1 - C_3 烷基或 C_1 - C_3 氟烷基；

R^2 為 H、 C_1 - C_2 烷基或 C_1 - C_3 氟烷基；

R^3 為示例 1 中示出的 U-1 至 U-11 中的一者，其中向左
伸出的鍵連接至式 1；

k 為 0、1 或 2；或者

R^3 為 H、氟基、羥基、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_1 - C_3
烷氧基、 C_1 - C_3 鹵烷氧基、 C_1 - C_3 烷硫基、 C_1 - C_3 鹵
烷硫基、 C_2 - C_3 烷基羰基氧基或 C_2 - C_3 鹵烷基羰基氧
基；

Q 選自 Q-1、Q-20、Q-32 至 Q-34、Q-45 至 Q-47、Q-60
至 Q-73、Q-76 至 Q-79、Q-84 至 Q-94 和 Q-98 至
Q-102；

每個 R^{6a} 獨立地為鹵素、羥基、氰基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基或 C_1-C_2 烷氧基；以及
 R^7 為 H 或甲基。

5. 根據申請專利範圍第 4 項所述之化合物，其中：

A 為 -O-；

G 選自 G-1、G-2、G-15、G-26、G-27、G-36、G-37 和
 G-38；

J 選自 J-4、J-5、J-8、J-11、J-15、J-16、J-20、J-29、J-30、
 J-37、J-38 和 J-69；

X 為 X^1 ；

R^1 為 H、甲基、三氟甲基或 CF_3CH_2 ；

R^2 為 H、甲基或三氟甲基；

R^3 為 H、氰基、甲基、甲氧基或 $CH_3C(=O)O-$ ；

R^4 為 H；

每個 R^6 獨立地為 H、氰基、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、
 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；

Q 選自 Q-1、Q-45、Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、Q-69、
 Q-70、Q-71、Q-72、Q-73、Q-76、Q-78、Q-79、
 Q-84、Q-85、Q-98、Q-99、Q-100、Q-101 和 Q-102。

6. 根據申請專利範圍第 5 項所述之化合物，其中：

G 選自 G-1、G-2、G-15、G-26 和 G-36；

x 為 1 或 2；

J 選自 J-4、J-5、J-11、J-20、J-29、J-37、J-38 和 J-69；

R^1 為甲基、三氟甲基或 CF_3CH_2 ；

R^3 為 H；

每個 R^6 獨立地為 H、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基或 $-Z^2Q$ ；

Q 選自 Q-45、Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、Q-69、Q-70、

Q-71、Q-72、Q-84 和 Q-85；並且

- 5 每個 R^{6a} 獨立地為 F、Cl、Br、羥基、氰基、甲基或甲氧基。

7. 根據申請專利範圍第 6 項所述之化合物，其中：

○ G 為 G-1；

10 x 為 1；

J 為 J-29；

R^6 為 $-Z^2Q$ ；並且

Q 選自 Q-45、Q-63、Q-70、Q-71、Q-72 和 Q-84。

15 8. 根據申請專利範圍第 6 項所述之化合物，其中

○ Q 為 Q-45；

p 為 1 或 2；並且

每個 R^{6a} 為 F。

20 9. 根據申請專利範圍第 6 項所述之化合物，其中

○ Q 為 Q-45；

p 為 1；並且

R^{6a} 為氰基或甲基。

25 10. 根據申請專利範圍第 1 項所述之化合物，選自：

2,2,2-三氟乙醛 2-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]-2-甲基脞；

2-[4,5-二氫-3-[2-[1-[2-[[2,2,2-三氟亞乙基)胺基]氧基]乙醯基]-4-哌啶基]-4-噻唑基]-5-異噁唑基]苜腓；

5 2,2,2-三氟乙醛 *O*-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]脞；

1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[4,5-二氫-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑基-1-基]乙酮；

10 1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[4,5-二氫-5-甲基-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑基-1-基]乙酮；

1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[4,5-二氫-5,5-二甲基-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-1-基]乙酮；

15 2,2,2-三氟乙醛, *O*-[2-[4-[4-(2,3-二氫螺[1*H*-茛-1,5'(4'*H*)-異噁唑]-3'-基)-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]脞；

2,2,2-三氟乙醛, *O*-[2-[4-[4-[4,5-二氫-5-(2-側氧(2*H*)-苯并噁唑基)-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]脞；

20 1,1,1-三氟-2-丙酮, *O*-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]脞；

2-丙酮, *O*-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]脞；

25 2-[4,5-二氫-3-[2-[1-[2-[[2,2,2-三氟-1-甲基亞乙基)胺基]氧基]乙醯基]-4-哌啶基]-4-噻唑基]-5-異噁唑基]苜腓；

1,1,1-三氟-2-丙酮, *O*-[2-[4-[4-[4,5-二氫-5-(2-側氧-3-(2*H*)-
苯并噁唑基)-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙
基] 肱; 以及

2-丙酮, *O*-[2-[4-[4-[5-(1,3-二氫-1,3-二側氧-2*H*-異吡啶-2-
5 基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙
基] 肱。

11. 一種殺真菌組合物, 包含(a)根據申請專利範圍第 1 項所
述之化合物; 和(b)至少一種其他殺真菌劑。

10

12. 一種殺真菌組合物, 包含(a)根據申請專利範圍第 1 項所
述之化合物; 和(b)至少一種選自表面活性劑、固體稀釋
劑和液體稀釋劑的額外組分。

15 13. 一種用於控制由真菌植物病原體引起的植物病害的方
法, 包括向植物或其部分或者向植物種子施用殺真菌有
效量的根據申請專利範圍第 1 項所述之化合物。

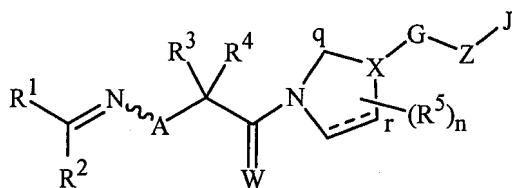
20 14. 一種用於控制由卵菌綱真菌植物病原體引起的植物病害
的方法, 包括向植物或其部分或者向植物種子施用殺真
菌有效量的根據申請專利範圍第 1 項所述之化合物。

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第(無)圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



1

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：99141182

C07D 417/04 (2006.01)

※申請日：98.12.2

※IPC 分類：C07D 417/14 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

A01N 43/78 (2006.01)

殺真菌雜環化合物

A01N 43/40 (2006.01)

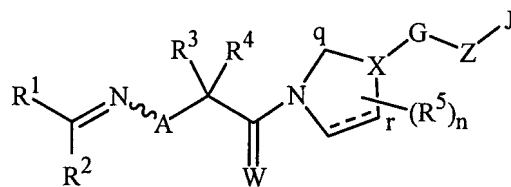
FUNGICIDAL HETEROCYCLIC COMPOUNDS

A01P 3/00 (2006.01)

(2006.01)

二、中文發明摘要：

本發明公開了式 1 化合物，包括其所有幾何和立體異構體、互變異構體、*N*-氧化物以及其鹽，



1

其中

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、A、W、X、G、Z、J 和 n 是如本公開中所定義。

本發明還公開了含有所述式 1 化合物的組合物和用於控制由真菌病原體引起的植物病害的方法，所述方法包括施用有效量的本發明化合物或組合物。

六、發明說明：

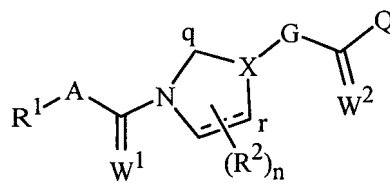
【發明所屬之技術領域】

本發明涉及某些雜環化合物，它們的互變異構體、*N*-氧化物、鹽和組合物，以及將它們用作殺真菌劑的方法。

【先前技術】

控制由真菌植物病原體引起的植物病害對於獲得高產量的農作物而言非常重要。植物病害損傷觀賞植物、蔬菜、田間作物、穀類和水果作物，會引起明顯的產量下降，從而導致消費者的費用增加。用於這些目的的很多產品可商業獲得，但是還需要更有效、更低花費、更低毒性、對環境更安全或具有不同作用位點的新型化合物。

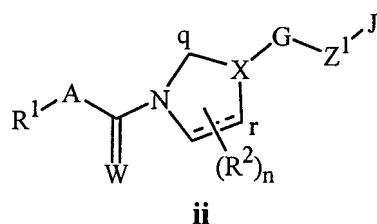
PCT 專利公開申請案第 WO 2007/014290 號揭露了式 i 甲醯胺衍生物



i

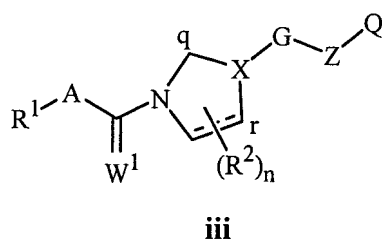
及其作為殺真菌劑的用途。

PCT 專利公開申請案第 WO 2008/013925 號揭露了作為殺真菌劑的式 ii 偶氮環醯胺，



及其作為殺真菌劑的用途。

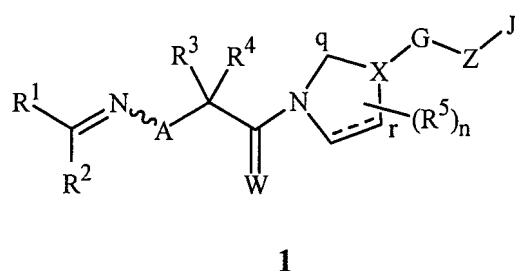
PCT 世界專利公開申請案第 WO 2008/091580 號公開了作為殺真菌劑的式 iii 醯胺衍生物，



及其作為殺真菌劑的用途。

【發明內容】

本發明涉及式 1 化合物(包括所有幾何異構體和立體異構體)、它們的互變異構體、*N*-氧化物和其鹽，含有它們的農用組合物以及它們作為殺菌劑的用途：



其中

A 為 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-N(R^7)-$ 、 $-C(R^8)_2-$ 、 $-OC(R^8)_2-$ 、 $-SC(R^8)_2-$ 或 $-N(R^7)C(R^8)_2-$ ，

其中向左伸出的鍵連接至式 1 的氮原子，而向右伸出的鍵連接至式 1 的碳原子；

W 為 O 或 S；

G 為經任選取代的 5 員雜環；

Z 為直接鍵、O、 $C(=O)$ 、 $S(=O)_m$ 、 $CH(R^{12})$ 或 $N(R^{13})$ ；

J 是 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而矽原子環員獨立選自 SiR^9R^{10} ，每個環或環系統任選經最多 5 個獨立選自 R^6 的取代基取代；或者

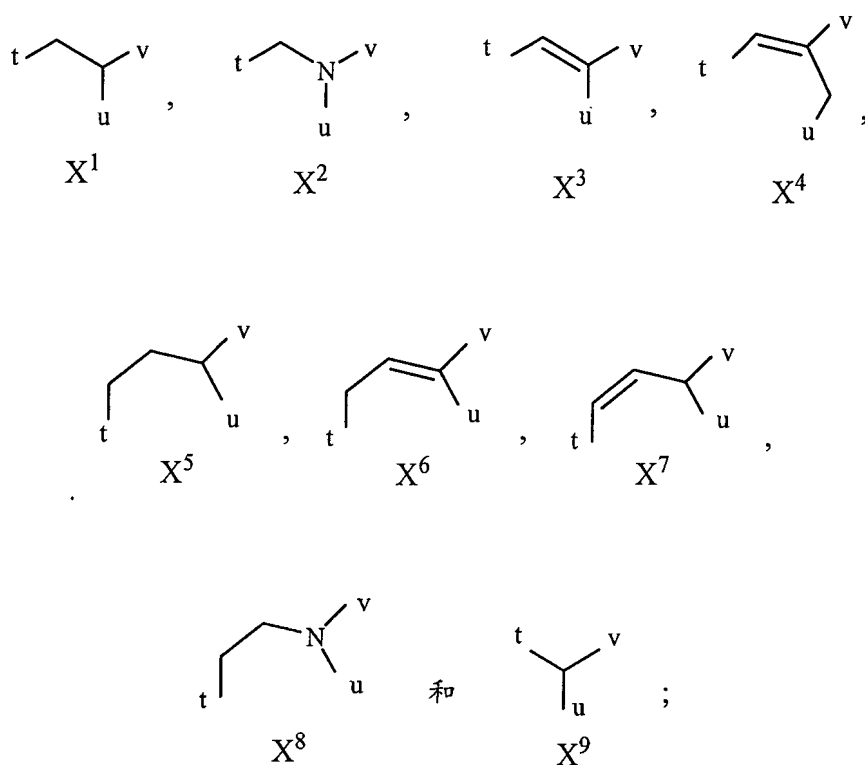
當 Z 為直接鍵時，則 J 也為 $C(=W^2)NT^AT^B$ ；

W^2 為 O 或 S；

T^A 為 H 或 C_1 - C_3 烷基；

T^B 為 $CR^{14}R^{15}R^{16}$ ；

X 為選自如下的基團：



其中 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 X^7 、 X^8 或 X^9 的用「t」標識的鍵連接至式 1 的用「q」標識的碳原子，用「u」標識的鍵連接至式 1 的用「r」標識的碳原子，而用「v」標識的鍵則連接至式 1 的 G；

R^1 為 H、鹵素、氰基、胺基、-CHO、-C(=O)OH、-C(=O)NH₂、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基、C₂-C₆ 炔基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₂-C₆ 鹵烯基、C₂-C₆ 鹵炔基、C₃-C₆ 環烷基、C₃-C₆ 鹵環烷基、C₄-C₆ 烷基環烷基、C₄-C₆ 環烷基烷基、C₄-C₆ 鹵環烷基烷基、C₃-C₆ 環烯基、C₃-C₆ 鹵環烯基、C₂-C₆ 烷氧基烷基、C₂-C₆ 烷硫基烷基、C₂-C₆ 烷基亞磺基烷基、C₂-C₆ 烷基磺基烷基、C₂-C₆ 烷基胺基烷基、C₃-C₆ 二烷基胺基烷基、C₂-C₆ 鹵烷基胺基

烷基、C₂-C₆ 烷基羰基、C₂-C₆ 鹵烷基羰基、C₄-C₆ 環烷基羰基、C₂-C₆ 烷氧基羰基、C₄-C₆ 環烷氧基羰基、C₅-C₆ 環烷基烷氧基羰基、C₂-C₆ 烷基胺基羰基、C₃-C₆ 二烷基胺基羰基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、C₃-C₆ 環烷氧基、C₃-C₆ 鹵環烷氧基、C₂-C₆ 烯氧基、C₂-C₆ 鹵烯氧基、C₂-C₆ 炔氧基、C₃-C₆ 鹵炔氧基、C₂-C₆ 烷氧基烷氧基、C₂-C₆ 烷基羰基氧基、C₂-C₆ 鹵烷基羰基氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 鹵烷硫基、C₃-C₆ 環烷硫基、C₁-C₆ 烷基胺基、C₂-C₆ 二烷基胺基、C₁-C₆ 鹵烷基胺基、C₂-C₆ 鹵二烷基胺基、C₃-C₆ 環烷基胺基、C₂-C₆ 烷基羰基胺基、C₂-C₆ 鹵烷基羰基胺基、C₁-C₆ 烷基磺醯基胺基或 C₁-C₆ 鹵烷基磺醯基胺基；

R² 是 H、鹵素、氰基、羥基、C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基或 C₁-C₃ 烷硫基；或者

R¹ 和 R² 與它們連接的碳原子一起形成 3-至 7-員環，該環含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 2 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 C(=O)和 C(=S)，硫原子環員獨立選自 S(=O)_s(=NR¹¹)_f 而矽原子環員獨立選自 SiR⁹R¹⁰，該環任選經最多 4 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₁-C₂ 烷氧基和 C₁-C₂ 鹵烷

氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1 - C_2 烷基和
 C_1 - C_2 烷氧基的取代基取代；

R^3 為經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任
 選取代的 5-至 6-員雜芳環；或 H、鹵素、氰基、
 羥基、-CHO、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4
 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 鹵烯基、 C_2 - C_4 鹵炔
 基、 C_2 - C_4 烷氧基烷基、 C_2 - C_4 烷硫基烷基、 C_2 - C_4
 烷基亞磺醯基烷基、 C_2 - C_4 烷基磺醯基烷基、
 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_5 烷氧
 基羰基、 C_2 - C_5 烷基胺基羰基、 C_3 - C_5 二烷基胺
 基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4
 烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、
 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯基、
 C_1 - C_4 鹵烷基磺醯基、 C_2 - C_4 烷基羰基氧基、
 C_2 - C_4 鹵烷基羰基氧基、 C_2 - C_5 烷氧基羰基氧
 基、 C_2 - C_5 烷基胺基羰基氧基或 C_3 - C_5 二烷基胺
 基羰基氧基；

R^4 為 H、 C_1 - C_3 烷基或 C_1 - C_3 鹵烷基；或者

R^3 和 R^4 與它們連接的碳原子一起形成 3-至 6-員飽
 和碳環；

每個 R^5 獨立地是鹵素、氰基、羥基、 C_1 - C_4 烷基、
 C_1 - C_4 烯基、 C_1 - C_4 鹵烷基或 C_1 - C_4 烷氧基；或
 者

兩個 R^5 基團合在一起為 C_1 - C_4 伸烷基或 C_2 - C_4 伸烯
 基，以形成橋聯雙環系統或稠合的雙環系統；
 或者

與由雙鍵接合的相鄰環碳原子連接的兩個 R^5 基團合在一起為 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ ，該 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ 任選經最多 3 個獨立選自鹵素、氰基、羥基、胺基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 鹵烷氧基的取代基取代；

每個 R^6 獨立地為 H、鹵素、氰基、羥基、胺基、硝基、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ 、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵炔基、 C_3-C_8 環烷基、 C_3-C_8 鹵環烷基、 C_4-C_{10} 烷基環烷基、 C_4-C_{10} 環烷基烷基、 C_6-C_{14} 環烷基環烷基、 C_4-C_{10} 鹵環烷基烷基、 C_5-C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_3-C_8 環烯基、 C_3-C_8 鹵環烯基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 C_4-C_{10} 環烷氧基烷基、 C_3-C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2-C_6 烷硫基烷基、 C_2-C_6 烷基亞磺醯基烷基、 C_2-C_6 烷基磺醯基烷基、 C_2-C_6 烷基胺基烷基、 C_3-C_8 二烷基胺基烷基、 C_2-C_6 鹵烷基胺基烷基、 C_4-C_{10} 環烷基胺基烷基、 C_2-C_6 烷基羰基、 C_2-C_6 鹵烷基羰基、 C_4-C_8 環烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_4-C_8 環烷氧基羰基、 C_5-C_{10} 環烷基烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基胺基羰基、 C_3-C_8 二烷基胺基羰基、 C_4-C_8 環烷基胺基羰基、 C_2-C_6 鹵烷氧基烷基、 C_1-C_6 羥烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_3-C_8 環烷氧基、 C_3-C_8 鹵環烷氧基、 C_4-C_{10} 環烷基烷氧基、 C_2-C_6 烯氧基、 C_2-C_6 鹵烯氧基、

C₂-C₆ 炔氧基、C₂-C₆ 鹵炔氧基、C₂-C₆ 烷氧基烷
 氧基、C₂-C₆ 烷基羰基氧基、C₂-C₆ 鹵烷基羰基
 氧基、C₄-C₈ 環烷基羰基氧基、C₃-C₆ 烷基羰基
 烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 鹵烷硫基、C₃-C₈
 環烷硫基、C₁-C₆ 烷基亞磺醯基、C₁-C₆ 鹵烷基
 亞磺醯基、C₁-C₆ 烷基磺醯基、C₁-C₆ 鹵烷基磺
 醯基、C₃-C₈ 環烷基磺醯基、C₃-C₁₀ 三烷基矽烷
 基、C₁-C₆ 烷基磺醯基胺基、C₁-C₆ 鹵烷基磺醯
 基胺基、-NR¹⁷R¹⁸ 或 -Z²Q；

每個 Z² 獨立地是直接鍵、O、C(=O)、S(O)_m、CH(R¹²)
 或 N(R¹³)；

每個 Q 獨立地為苯基、苜基、萘基、5-至 6-員雜芳
 環或 8-至 11-員雜芳族雙環系統，各任選經最
 多 2 個獨立選自碳和氮原子環員上的 R^{6b} 的取
 代基取代，並且各任選經最多 5 個獨立選自碳
 原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的 C₁-C₃ 烷
 基、C₂-C₃ 烷基羰基、C₂-C₃ 烷氧基羰基或 C₁-C₃
 烷氧基的取代基取代；或者

3-至 7-員非芳族碳環、5-至 7-員非芳族雜環或
 8-至 11-員非芳族雙環系統，每個環或環系統含
 有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述
 雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最
 多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳
 原子環員獨立選自 C(=O)和 C(=S)，硫原子環員
 獨立選自 S(=O)_s(=NR¹¹)_f，而矽原子環員獨立選
 自 SiR⁹R¹⁰，每個環或環系統的碳和氮原子環員

任選經最多 2 個獨立選自 R^{6b} 的取代基取代，最多 5 個獨立選自碳原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 烷氧基羰基和 C_1-C_3 烷氧基的取代基；

每個 R^{6a} 獨立地是鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_4-C_{10} 環烷基烷基、 C_4-C_{10} 烷基環烷基、 C_5-C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_6-C_{14} 環烷基環烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵炔基、 C_3-C_6 鹵環烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 鹵烷硫基、 C_1-C_4 烷基亞磺基、 C_1-C_4 烷基磺基、 C_1-C_4 鹵烷基亞磺基、 C_1-C_4 鹵烷基磺基、 C_1-C_4 烷基胺基、 C_2-C_8 二烷基胺基、 C_3-C_6 環烷基胺基、 C_2-C_4 烷氧基烷基、 C_1-C_4 羥烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 烷基羰硫基、 C_2-C_6 烷基胺基羰基、 C_3-C_8 二烷基胺基羰基或 C_3-C_6 三烷基矽烷基；或

R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成 5-至 7-員環，該環含有選自碳原子和任選最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

每個 R^{6b} 獨立地為任選經最多 3 個獨立選自如下的
 取代基取代的苯基：鹵素、氰基、 C_1-C_2 烷基、
 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基；
 或

5-至 6-員雜芳環，該雜芳環含有選自碳原子和
 最多 4 個獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和
 最多 4 個 N 原子的雜原子的環員，該環任選經
 最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰
 基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基和
 C_1-C_2 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2
 烷基和 C_1-C_2 烷氧基；或

3-至 7-員非芳族環，該環含有選自如下的環
 員：碳原子和最多 4 個獨立選自最多 2 個 O、
 最多 2 個 S 和最多 4 個 N 原子的雜原子，其中
 最多 3 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，
 該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的
 鹵素、氰基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2
 烷氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基和氮環原子上的氰
 基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

R^7 是 H、氰基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_2-C_4
 烷氧基烷基、 C_2-C_4 烷硫基烷基、 C_2-C_4 烷基羰
 基、 C_2-C_4 鹵烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基、 C_2-C_4
 烷基胺基羰基、 C_3-C_5 二烷基胺基羰基、 C_1-C_4
 烷基磺醯基或 C_1-C_4 鹵烷基磺醯基；或者

R^2 和 R^7 與它們連接的連接原子一起形成 5-至 7-員
 部分不飽和環，除了連接原子外，該環還含有

選自如下的環員：碳原子和最多 3 個獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子的雜原子，該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員的鹵素、氰基、硝基、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₁-C₂ 烷氧基和 C₁-C₂ 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 烷氧基的取代基取代；

每個 R⁸ 獨立地為 H、C₁-C₃ 烷基或 C₁-C₃ 鹵烷基；

每個 R⁹ 和 R¹⁰ 獨立地為 C₁-C₅ 烷基、C₂-C₅ 烯基、C₂-C₅ 炔基、C₃-C₅ 環烷基、C₃-C₆ 鹵環烷基、C₄-C₁₀ 環烷基烷基、C₄-C₇ 烷基環烷基、C₅-C₇ 烷基環烷基烷基、C₁-C₅ 鹵烷基、C₁-C₅ 烷氧基或 C₁-C₅ 鹵烷氧基；

每個 R¹¹ 獨立地是 H、氰基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₃-C₈ 環烷基、C₃-C₈ 鹵環烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、C₁-C₆ 烷基胺基、C₂-C₈ 二烷基胺基、C₁-C₆ 鹵烷基胺基或苯基；

每個 R¹² 獨立地是 H、C₁-C₄ 烷基或 C₁-C₄ 鹵烷基；

每個 R¹³ 獨立地是 H、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 鹵烷基、C₃-C₆ 環烷基、C₂-C₄ 烷基羰基、C₂-C₄ 鹵烷基羰基、C₂-C₄ 烷氧基羰基或 C₂-C₄ 鹵烷氧基羰基；

R¹⁴ 為 H 或 C₁-C₄ 烷基；

R¹⁵ 為苯基、苜基、萘基或 5-至 6-員雜芳環，各在環員上任選經最多 3 個獨立選自 R¹⁹ 的取代基取代；

R^{16} 為 H、氰基、硝基、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基或
 C_2 - C_6 炔基；

每個 R^{17} 獨立地是 H、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、
 C_3 - C_8 環烷基、 C_2 - C_6 烷基羰基、 C_2 - C_6 鹵烷基
羰基、 C_2 - C_6 烷氧基羰基或 C_2 - C_6 鹵烷氧基羰
基；

每個 R^{18} 獨立地為 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_3 - C_8
環烷基、 C_2 - C_6 烷基羰基、 C_2 - C_6 鹵烷基羰基、
 C_2 - C_6 烷氧基羰基、 C_2 - C_6 鹵烷氧基羰基或
 $-Z^3Q$ ；

每個 R^{19} 獨立地為鹵素、氰基、羥基、 C_1 - C_3 烷基、
 C_1 - C_3 鹵烷基或 C_1 - C_3 烷氧基；或者

R^{16} 和 R^{19} 與它們連接至的原子一起形成 3-至 7-員
環，該環含有選自如下的環員：碳原子和最多
4 個獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多
2 個 N 和最多 2 個 Si 原子的雜原子，其中最
多 2 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，
硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而矽原
子環員獨立選自 SiR^9R^{10} ，該環任選經最多 4
個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、羥
基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基和氮原子環員
上的氰基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基的取代
基取代；

每個 Z^3 獨立地為 O、 $C(=O)$ 、 $S(=O)_m$ 或 $CH(R^{12})$ ；

每個 m 獨立地為 0、1 或 2；

n 為 0、1 或 2；並且

s 和 f 在每種 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ 的情況下都獨立地為 0、1 或 2，前提條件是 s 與 f 之和為 0、1 或 2。

更具體地講，本發明涉及式 1 化合物（包括所有幾何異構體和立體異構體）、它們的互變異構體、N-氧化物或鹽。

本發明還涉及一種殺真菌組合物，其包含(a)式 1 之化合物；和(b)至少一種額外組分，所述額外組分選自表面活性劑、固體稀釋劑和液體稀釋劑。

本發明還涉及一種殺真菌組合物，其包含(a)式 1 化合物；和(b)至少一種其他殺真菌劑（例如，至少一種具有不同作用位點的其他殺真菌劑）。

本發明還涉及用於控制由真菌植物病原體引起的植物病害的方法，包括向植物或其部分或者向植物種子施用殺真菌有效量的本發明化合物（例如，本文所述的組合物）。

【實施方式】

如本文所用，術語「包含」、「包含有」、「包括」、「包括有」、「有」、「具有」、「含」或「含有」、「其特徵在於」或其任何其他變型形式都旨在涵蓋非排它性的包括，但亦受到任何明示指出之限定。例如，包括一系列元素的組合物、混合物、製程或方法並不一定僅受限於那些元素，而是可包括未針對這類組合物、混合物、製程或方法明確列出的或這類組合物、混合物、製程或方法所固有的其他組成元素。

連接詞「由……所組成」排除任何未指定之元件、步驟或成分。若在申請專利範圍中使用此連接詞，則此會使該申請專利範圍限定在包括所述的材料，除了平常與其相關的雜質。當該連接詞「由……所組成」出現在一申請專利範圍之主體的子句中，而非直接接在前言之後時，其僅限定子句中所述之元件，其他元件非排除於該申請專利範圍作為一整體之外。

連接詞「基本上由……所組成」係用以定義一組成物或方法，該組成物或方法包括明文所述者以外之材料、步驟、特徵、組分或元件，倘若這些額外之材料、步驟、特徵、組分或元件不會實質上影響該所主張之發明的基本與新穎特徵。

在申請人以一開放性術語如「包含」來定義一發明或其一部分時，應立即瞭解到（除非另有說明）應將該描述解讀為亦使用術語「基本上由……所組成」或「由……所組成」來描述此一發明。

而且，除非明確說明與此相反，否則「或」指包涵性的或並且不是指排他性的或。例如，下面任一種情況均滿足條件 A 或 B：A 為真（或存在）而 B 是假（或不存在）、A 為假（或不存在）而 B 為真（或存在），以及 A 和 B 均為真（或存在）。

另外，在本發明的元素或組分前面的不定冠詞「一個」和「一種」旨在表示就元素或組分的實例（即出現）數目而言是非限制性的。因此，「一個」或「一種」應該理解為包括一種或至少一種，並且元素或組分的單數形式也包含複數的意思，除非數值明顯地表示為單數。

如本發明和申請專利範圍所提及的，「植物」包括處於所有生命階段的植物界成員，特別是種子植物（Spermatopsida），包括幼株（例如，發育成籽苗的萌發種子）和成熟、生殖階段的植株（例如長出花和種子的植株）。植物的部分包括通常生長在生長介質（如土壤）表面以下的向地性部分，例如根、塊莖、鱗莖和球莖，而且還包括生長在生長介質之上的部分，例如葉（包括葉柄和葉）、花、果實和種子。

如本文所提及的，單獨使用的或在組合詞中使用的術語「籽苗」表示由種子的胚發育而來的幼株或無性繁殖單元如塊莖、球莖或根狀莖的芽。

在上面的敘述中，單獨使用的或在複合詞如「烷硫基」或「鹵烷基」中使用的術語「烷基」包括直鏈與支鏈的烷基，例如甲基、乙基、正丙基、異-丙基以及不同的丁基、戊基與己基異構體。「烯基」包括直鏈與支鏈的烯烴，例如乙烯基、1-丙烯基、2-丙烯基以及不同的丁烯基、戊烯基和己烯基異構體。「炔基」還包括多烯烴例如 1,2-丙二烯基和 2,4-己二烯基。「炔基」包括直鏈與支鏈的炔烴例如乙炔基、1-丙炔基、2-丙炔基和不同的丁炔基、戊炔基和己炔基異構體。「炔基」還可包括由多個三鍵組成的部分，例如 2,5-己二炔基。「伸烷基」表示直鏈或支鏈的烷二基。「伸烷基」的例子包括 CH_2 、 CH_2CH_2 、 $\text{CH}(\text{CH}_3)$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)$ 和不同的丁烯異構體。「伸烯基」表示直鏈或支鏈的含一個烯鍵的烯二基。「伸烯基」的例子包括 $\text{CH}=\text{CH}$ 、 $\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}$ 與 $\text{CH}=\text{C}(\text{CH}_3)$ 。

「烷氧基」包括（例如）甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基和不同的丁氧基、戊氧基和己氧基異構體。「烯氧基」包括直鏈與支鏈的連接至氧原子的烯基和通過氧原子相連的烯基。「烯氧基」的例子包括 $\text{H}_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 與 $(\text{CH}_3)_2\text{C}=\text{CHCH}_2\text{O}$ 。

「炔氧基」包括直鏈與支鏈的炔氧基部分。「炔氧基」的例子包括 $\text{HC}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ 、 $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{O}$ 和 $\text{CH}_3\text{C}\equiv\text{CCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 。術語「烷硫基」包括直鏈與支鏈的烷硫基部分，例如甲硫基、乙硫基和不同的丙硫基、丁硫基、戊硫基和己硫基異構體。「烷基亞磺醯基」包括烷基亞磺醯基的兩種鏡像異構物。「烷基亞磺醯基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(=\text{O})$ 以及不同的丁基亞磺醯基、戊基亞磺醯基和己基亞磺醯基異構體。「烷基磺醯基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(=\text{O})_2$ ，以及不同的丁基磺醯基、戊基磺醯基和己基磺醯基異構體。「烷基胺基」包括被直鏈或支鏈烷基團取代的 NH 基。「烷基胺基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NH}$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NH}$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}_2\text{NH}$ 。「二烷基胺基」的例子包括 $(\text{CH}_3)_2\text{N}$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2)_2\text{N}$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{N}$ 。

「烷基羰基」表示直鏈或支鏈結合至 $\text{C}(=\text{O})$ 部分的烷基。「烷基羰基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})$ 。「烷氧基羰基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})$ 以及不同的丁氧

基與戊氧基羰基異構體。「烷基胺基羰基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC}(=\text{O})$ 以及不同的丁基胺基與戊基胺基羰基異構體。「二烷基胺基胺基羰基」的例子包括 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ 、 $(\text{CH}_3)_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ 與 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})$ 。

「烷氧基烷基」表示烷基上的烷氧基取代。「烷氧基烷基」的例子包括 CH_3OCH_2 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 。「烷氧基烷氧基」表示另一個烷氧基部分上的烷氧基取代。「烷氧基烷氧基烷基」表示烷基上的烷氧基烷氧基取代。「烷氧基烷氧基烷基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{OCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{OCH}_2$ 。

「烷硫基烷基」表示烷基上的烷硫基取代。「烷硫基烷基」的例子包括 CH_3SCH_2 、 $\text{CH}_3\text{SCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{SCH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{SCH}_2\text{CH}_2$ ；「烷基亞磺醯基烷基」和「烷基磺醯基烷基」分別包括對應的亞磺和磺。「烷基羰基硫基」表示直鏈或支鏈的連接至硫原子和通過硫原子相連的烷基羰基。「烷基羰基硫基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{S}$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{S}$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})\text{S}$ 。

「烷基胺基烷基」表示烷基上的烷基胺基取代。「烷基胺基烷基」的例子包括 CH_3NHCH_2 、 $\text{CH}_3\text{NHCH}_2\text{CH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHCH}_2$ 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHCH}_2$ 和

$\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHCH}_2\text{CH}_2$ 。「二烷基胺基烷基」的例子包括 $((\text{CH}_3)_2\text{CH})_2\text{NCH}_2$ 、 $(\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2)_2\text{NCH}_2$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NCH}_2\text{CH}_2$ 。

術語「烷基羰基胺基」表示與 $\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ 部分鍵合的烷基。「烷基羰基胺基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{NH}$ 。「烷基磺醯基胺基」表示被烷基磺醯基取代的 NH 基。「烷基磺醯基胺基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2\text{NH}$ 與 $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(=\text{O})_2\text{NH}$ 。

術語「烷基羰基氧基」表示一直鏈或支鏈的與 $\text{C}(=\text{O})\text{O}$ 部分鍵合的烷基。「烷基羰基氧基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{O}$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})\text{O}$ 。術語「烷基羰基烷氧基」表示與烷氧基部分鍵合的烷基羰基。「烷基羰基烷氧基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{O}$ 。「烷氧基羰基氧基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})\text{O}$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})\text{O}$ 。

術語「烷基胺基羰基氧基」表示一直鏈或支鏈的連接至氧原子和通過氧原子相連的烷基胺基羰基。「烷基胺基羰基氧基」的例子包括 $(\text{CH}_3)_2\text{CHCH}_2\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ 和 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC}(=\text{O})\text{O}$ 。「二烷基胺基羰基氧基」的例子包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC}(=\text{O})\text{O}$ 和 $(\text{CH}_3)_2\text{NC}(=\text{O})\text{O}$ 。

「環烷基」包括（例如）環丙基、環丁基、環戊基和環己基。術語「環烷基烷基」表示烷基部分上的環烷基取代。「環烷基烷基」的例子包括環丙基甲基、環戊基乙基，以及與一直鏈或支鏈烷基鍵合的其他環烷基部分。術語「烷基環烷基」表示環烷基部分上的烷基取代，並且包括（例如）乙基環丙基、異丙基環丁基、甲基環

戊基和甲基環己基。「環烯基」包括諸如環戊烯基和環己烯基之類的基團以及具有不止一個雙鍵的基團如1,3-或1,4-環己二烯基。

術語「環烷氧基」表示連接至氧原子和通過氧原子相連的環烷基，例如環戊氧基和環己氧基。術語「環烷硫基」表示連接至硫原子和通過硫原子相連的環烷基，例如環丙硫基和環戊硫基；「環烷基磺醯基」包括相應的磺。術語「環烷氧基烷基」表示烷基部分上的環烷氧基取代。「環烷氧基烷基」的例子包括環丙氧基甲基、環戊氧基乙基和其他與一直鏈或支鏈烷基部分鍵合的環烷氧基團。「環烷基烷氧基」表示烷氧基部分上的環烷基取代。「環烷基烷氧基」的例子包括環丙基甲氧基、環戊基乙氧基，以及其他與一直鏈或支鏈烷氧基部分鍵合的環烷基團。

「烷基環烷基烷基」表示被烷基環烷基取代的烷基。「烷基環烷基烷基」的例子包括甲基環己基甲基或乙基環己基甲基。術語「環烷基環烷基」表示另一個環烷基環上的環烷基取代，其中每個環烷基環獨立地具有3至7個碳原子環員。環烷基環烷基的例子包括環丙基環丙基（例如1,1'-二環丙基-1-基、1,1'-二環丙基-2-基）、環己基環戊基（例如4-環戊基環己基）和環己基環己基（例如1,1'-二環己基-1-基），以及不同的順式-和反式-環烷基環烷基異構體（例如(1*R*,2*S*)-1,1'-二環丙基-2-基和(1*R*,2*R*)-1,1'-二環丙基-2-基）。

「環烷基胺基」表示被環烷基取代的NH基。「環烷基胺基」的例子包括環丙基胺基和環己基胺基。術語

「環烷基胺基烷基」表示烷基上的環烷基胺基取代。「環烷基胺基烷基」的例子包括環丙基胺基甲基、環戊基胺基乙基，以及其他與一直鏈或支鏈烷基鍵合的環烷基胺基部分。

「環烷基羰基」表示與 C(=O)基團鍵合的環烷基，包括（例如）環丙基羰基和環戊基羰基。術語「環烷氧基羰基」表示與 C(=O)基團鍵合的環烷氧基，例如環丙氧基羰基和環戊氧基羰基。「環烷基胺基羰基」表示與 C(=O)基團鍵合的環烷基胺基，例如環戊基胺基羰基和環己基胺基羰基。「環烷基烷氧基羰基」表示與 C(=O)基團鍵合的環烷基烷氧基。「環烷基烷氧基羰基」的例子包括環丙基乙氧基羰基和環戊基甲氧基羰基。「環烷基羰基氧基」表示連接至氧原子和通過氧原子相連的環烷基羰基。「環烷基羰基氧基」的例子包括環己基羰基氧基和環戊基羰基氧基。

單獨使用或在複合詞如「鹵烷基」中使用，或在諸如「鹵素取代的烷基」之類的描述中使用時，術語「鹵素」均包括氟、氯、溴或碘。而且，當在複合詞如「鹵烷基」中使用時，或者在諸如「鹵素取代的烷基」之類的描述中使用時，所述烷基可用相同或不同的鹵素原子部分取代或完全取代。「鹵烷基」或「鹵素取代的烷基」的例子包括 F_3C 、 $ClCH_2$ 、 CF_3CH_2 和 CF_3CCl_2 。術語「鹵烯基」、「鹵炔基」、「鹵烷氧基」、「鹵烷硫基」、「鹵烷基胺基」、「鹵烷基亞磺醯基」、「鹵烷基磺醯基」、「鹵環烷基」等與術語「鹵烷基」的定義類似。「鹵烯基」的例子包括 $(Cl)_2C=CHCH_2$ 和 $CF_3CH_2CH=CHCH_2$ 。「鹵炔基」

的例子包括 $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$ 、 $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$ 、 $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$ 和 $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2$ 。「鹵烷氧基」的例子包括 CF_3O 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$ 、 $\text{F}_2\text{CHCH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 和 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$ 。「鹵烷硫基」的例子包括 CCl_3S 、 CF_3S 、 $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}$ 和 $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}$ 。「鹵烷基胺基」的例子包括 $\text{CF}_3(\text{CH}_3)\text{CHNH}$ 、 $(\text{CF}_3)_2\text{CHNH}$ 和 $\text{CH}_2\text{ClCH}_2\text{NH}$ 。「鹵烷基亞磺醯基」的例子包括 $\text{CF}_3\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(=\text{O})$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})$ 和 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(=\text{O})$ 。「鹵烷基磺醯基」的例子包括 $\text{CF}_3\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CCl}_3\text{S}(=\text{O})_2$ 、 $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(=\text{O})_2$ 和 $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(=\text{O})_2$ 。「鹵環烷基」的例子包括 2-氯環丙基、2-氟環丁基、3-溴環戊基和 4-氯環己基。單獨使用或在複合詞如「鹵二烷基胺基」中使用的術語「鹵二烷基」表示兩個烷基中的至少一者用至少一種鹵素原子取代，並且獨立的是各個鹵化烷基可用相同或不同的鹵素原子部分取代或完全取代。「鹵二烷基胺基」的例子包括 $(\text{BrCH}_2\text{CH}_2)_2\text{N}$ 和 $\text{BrCH}_2\text{CH}_2(\text{ClCH}_2\text{CH}_2)\text{N}$ 。

「羥基烷基」表示一被一羥基團取代之烷基。「羥基烷基」的例子包括 HOCH_2CH_2 、 $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{OH})\text{CH}$ 與 $\text{HOCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2$ 。

「三烷基矽烷基」包括 3 個連結且聯接於一矽原子的支鏈與／或直鏈烷基，例如三甲基矽烷基、三乙基矽烷基與三級丁基二甲基矽烷基。

在一取代基團中的碳原子總數係由「 $\text{C}_i\text{-C}_j$ 」前綴指示，其中 i 與 j 係為由 1 至 14 的數字。例如， $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基磺醯基表示甲基磺醯基至乙基磺醯基； C_2 烷氧基烷基表示 CH_3OCH_2 ； C_3 烷氧基烷基表示如

$\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$ 、 $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 或 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$ ；以及 C_4 烷氧基烷基表示一經一烷氧基團取代之一烷基團的各式異構體，該烷氧基團含有總共四個碳原子，例子包括 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ 與 $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$ 。

術語「未取代」在與一基團如一環或環系統連結使用時，係指該基團在其一或多個連結處外不具有任何取代基在該式 1 的剩餘位置上。術語「任選經取代」係指取代基的數目可以為零。除非另有指明，任選經取代的基團可被許多任選的取代基取代，只要該藉由用一非氫取代基在任何可得的碳或氮原子上替換一氫原子的取代仍可配合。通常該任選取代基（若存在時）的數字介於由 1 至 4。如本文中所用，術語「任選經取代」係可與片語「取代或未取代」或術語「(未)取代」互換使用。當一基團（例如 J）含有一可為氫的取代基（例如 R^6 ）時，那麼當此取代基係為氫時，可理解為此係等同於該基團係為未取代的。

該任選取代基的數目可用明示的限定加以限制。例如，該片語「任選經最多 3 個獨立選自 R^6 的取代基」係指 0、1、2 或 3 個取代基可以存在（若該潛在連結點的數目許可時）。同樣地，該片語「任選經最多 5 個獨立選自 R^6 的取代基」係指 0、1、2、3、4 或 5 個取代基可以存在，若該潛在連結點的數目許可時。當一由該取代基數目所指定的範圍（例如在示例 3 中，x 為由 1 至 5 的整數）超過在一環上可得的取代基位置數目時（例如在示例 3 中，J-1 上的 $(\text{R}^6)_x$ 有 2 個位置可得），該

範圍實際上較高的一端點應認知為該可得位置的數目)。

當一化合物經一帶有下標(其係指該取代基的數目可以改變,如在示例3中的 $(R^6)_x$,其中 x 為1至5)的取代基取代時,那麼該取代基係獨立選自該定義的取代基所組成的群組,除非另有指明。當一可變的基團係顯示為任選連接在一位置上時,例如在示例5中的 $(R^{6a})_p$,而其中 p 可為0,那麼氫可在該位置即使該可變基團的定義未敘明。

使用術語「任選經取代」但未敘明數目或指出可能的取代基(例如在 G 與 R^3 中環的定義)時,係指基團未經取代或具有至少一個非氫取代基,該取代基與該未取代類似物所擁有的生物活性無法區別。

本揭露中的取代基命名使用公認的命名法,而簡明並準確地傳達化學結構予熟悉該項技術者。為簡明起見,位標(locant)的描述符號可加以省略。

除非另外指明,否則作為式1組成部分的「環」或「環系統」(例如取代基 J 和 Q)是碳環或雜環。術語「環系統」表示兩個或更多個相連的環。術語「螺環系統」表示由兩個在單個原子處連接的環組成的環系統(因此該環具有單個共有原子)。示例性的為螺環系統的 J 部分是下文示例A中所示出的J-29-27。術語「雙環系統」表示由兩個具有兩個或更多個共有原子的環組成的環系統。在「稠合的雙環系統」中,共有原子是相鄰的,並因此所述環共有兩個相鄰的原子和連接它們的鍵。在「橋聯雙環系統」中,共有原子不相鄰(即橋頭

原子之間不存在鍵)。「橋聯雙環系統」可通過一種或多種原子的鏈段與環中不相鄰的環員鍵合而形成。

環、雙環系統或螺環系統可以是含有不止兩個環的擴展的環系統的部分，其中環、雙環系統或螺環系統上的取代基可以合在一起形成另外的環，該環與該擴展的環系統的其他環為雙環和/或螺環關係。例如，下文示例 A 中示出的 J 部分 J-29-30 由被一個 R^6 取代基(其為 $-Z^2Q$ ，其中 Z^2 為 $-CH_2-$ 基團而 Q 為一經 R^{6a} 取代基 $(-CH_2-)$ 取代的苯環)取代的二氫異噁唑啉環組成，其中該 R^{6a} 取代基與該二氫異噁唑啉環上的另一 R^6 取代基 $(-CH_2-)$ 一起形成該環系統中的另外的六-員環。

術語「環員」指形成環或環系統的主鏈的原子(如 C、O、N 或 S)或其他部分(如 $C(=O)$ 、 $C(=S)$ 、 SiR^9R^{10} 或 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$)。術語「芳族」表示每個環原子基本上在同一平面內並且具有垂直於環平面的 p -軌道，並且表示所述環具有 $(4n + 2)$ 個 π 電子(其中 n 為正整數)以符合休克爾規則(Hückel's rule)。

術語「碳環」表示其中形成環主鏈的原子僅選自碳的環。除非另外指明，否則碳環可以是飽和的、部分不飽和的或完全不飽和的環。當完全不飽和的碳環滿足休克爾規則時，則所述環也稱為「芳族環」。「飽和碳環的」指其主鏈是由經單鍵彼此相連的碳原子組成的環；除非另外指明，否則剩餘的碳價由氫原子佔用。

如本文中所用，術語「部分不飽和環」或「部分不飽和雜環」係指含有不飽和環原子與一或多個非芳族雙鍵的環，例如一 4,5-二氫-1*H*-吡唑基-1-基環。

術語「雜合環」或「雜環」表示其中至少一個形成環主鏈的原子不是碳的環。除非另外指明，否則雜環可以是飽和的、部分飽和的或完全飽和的環。當完全飽和的雜環滿足休克爾規則時，所述環也稱為「雜芳環」或芳族雜環。「飽和雜環」指在環員之間僅含有單鍵的雜環。

除非另外指明，否則雜環和環系統經由任何可利用的碳或氮原子，通過置換所述碳或氮原子上的氫來連接至式 1 的其餘部分。

式 1 中和本發明所述的其他環中的虛線表示該鍵可以是單鍵或雙鍵。

氮原子和由式 1 中 A 所表示的原子之間的波狀鍵（和本發明所述的其他環中）指示一單鍵，並且指示鄰近雙鍵（即連接氮原子與 R^1 和 R^2 取代基的鍵）的幾何位置為順式-(E)、反式-(Z)或它們的組合。

如上所說明的，J（尤其）是 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而矽原子環員獨立選自 SiR^9R^{10} ，每個環或環系統任選經最多 5 個獨立選自 R^6 的取代基取代。在該定義中，選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子的環員是可選的，因為雜原子環員數可以為零。當不存在雜原子環員時，該環或環系統是碳環的。如果存

在至少一個雜原子環員，則該環或環系統是雜環的。 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ 的定義允許具有最多 2 個硫環員，其可以是氧化的硫部分（如 $S(=O)$ 或 $S(=O)_2$ ）或未氧化的硫原子（即 s 和 f 均為零時）。可以將氮原子環員氧化成 N -氧化物，因為與式 1 相關的化合物也包括 N -氧化物衍生物。選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ 的最多 3 個碳原子環員加在選自最多 2 個 O 、最多 2 個 S 、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子的最多 4 個雜原子上。由於 R^6 取代基是可選的，所以可以存在 0 至 5 個取代基，這僅受限於在 J 上可用的連接點的數目。當取代基 R^6 為 H ，則不計入為該 5 個取代基基中之一。矽原子環員上的取代基被獨立地定義為 R^9 和 R^{10} 。

如上文所說明的， R^1 和 R^2 可以與它們連接的碳原子一起形成 3-至 7-員環。該 3-至 7-員環包括取代基 R^1 和 R^2 與之連接的作為環員的碳原子。其他 2 至 6 個環員原子選自碳原子和最多 4 個獨立選自最多 2 個 O 、最多 2 個 S 、最多 2 個 N 和最多 2 個 Si 原子的雜原子。在該定義中，雜原子是可選的，因為雜原子環員的數目可以為零。當不存在雜原子環員時，該環是碳環的。如果存在至少一個雜原子環員，則該環是雜環的。該環可任選經最多 4 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代。可以將氮原子環員氧化成 N -氧化物，因為與式 1 相關的化合物也包括 N -氧化物衍生物。

如上文所說明的，Q（尤其）是 3-至 7-員非芳族碳環、5-至 7-員非芳族雜環或 8-至 11-員雜芳族雙環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 C(=O)和 C(=S)，硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而矽原子環員獨立選自 SiR^9R^{10} ，每個環或環系統的碳和氮原子環員任選經最多 2 個獨立選自 R^{6b} 的取代基取代，最多 5 個獨立選自碳原子環員上的 R^{6a} 和選自氮原子環員上的 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烷基羰基、 C_2 - C_3 烷氧基羰基和 C_1 - C_3 烷氧基的取代基。在該定義中，選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子的環員是可選的，因為雜原子環員數可以為零。當不存在雜原子環員原子時，該環或環系統是碳環的。如果存在至少一個雜原子環員，該環或環系統是雜環的。 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ 的定義允許具有最多 2 個硫環員，其可以是氧化的硫部分（如 S(=O)或 S(=O)₂）或未氧化的硫原子（即 s 和 f 均為零時）。可以將氮原子環員氧化成 N-氧化物，因為與式 1 相關的化合物也包括 N-氧化物衍生物。所述最多 3 個選自 C(=O)和 C(=S) 的碳原子環員加在所述最多 4 個選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子的雜原子上。

如上文所說明的， R^6 和 R^{6a} 可以與它們連接的原子一起形成 5-至 7-員環，其包括作為環員之：(a) 取代基 R^6 和 R^{6a} 直接連接的兩個原子、(b) J、 Z^2 和 Q 的居間（即其他連接的）原子，可以認為 R^6 和 R^{6a} 與該居間的原子

間接連接以及(c) R^6 和 R^{6a} 取代基。環的環員選自碳原子和可任選地最多 3 個獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子的雜原子。在該定義中，選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子的環員是可選的，因為雜原子環員數可以為零。該環在碳原子環員上任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代。這些任選的取代基（當存在時）連接至可用之碳原子環員和氮原子環員並連接在由 R^6 與 R^{6a} 所提供的環部分。

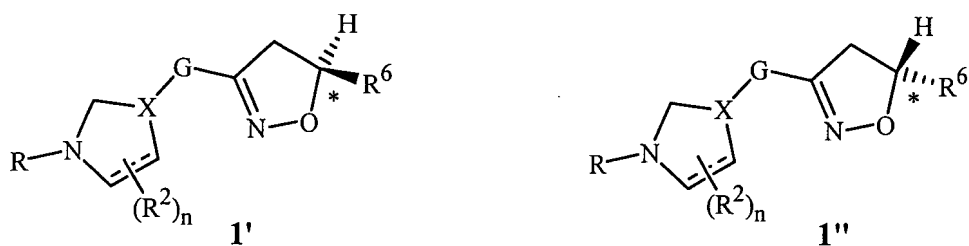
如上文所說明的， R^2 和 R^7 可以與它們所連接的連接原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環。該連接原子是 R^2 與之直接連接的碳原子、 R^7 與之直接連接的氮原子（只有當 A 為 $-N(R^7)-$ 時存在），以及式 1 中描述為「 $=N\sim$ 」的居間氮原子。因此，該 3 個連接原子為「 $-C=N\sim N(R^7)-$ 」。連接原子提供了 3 個 5-至 7-員環的環員。該環的其他 2 至 4 個環員由 R^2 和 R^7 取代基提供。這些其他的環員選自碳原子和最多 3 個獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子的雜原子。在該定義中，選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子的環員是可選的，因為雜原子環員數可以為零。該環可任選經最多 3 個獨立選自碳環員原子上的鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基和氮環員原子上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代。除了 R^1 和式 1 連接至該環的其餘部分外，這些可選的取代基（當存在時）連接至可用

的碳原子和氮原子環員並連接在由 R^2 與 R^7 所提供的環部分。可以將氮原子環員氧化成 N -氧化物，因為與式 1 相關的化合物也包括 N -氧化物衍生物。

如上文所說明的， R^{16} 和 R^{19} 可以與它們連接的原子一起形成 3-至 7-員環，其包括作為環員的：(a) 兩個與取代基 R^{16} 和 R^{19} 直接連接的原子、(b) 以及 R^{15} 的居間（即其他連接的）原子，可以認為 R^{16} 和 R^{19} 與該居間原子間接連接以及(c) R^{16} 和 R^{19} 取代基。環的環員選自碳原子和最多 4 個雜原子，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 2 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 2 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而矽原子環員獨立選自 SiR^9R^{10} ，該環任選經最多 4 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、羥基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基的取代基取代。在該定義中，選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 2 個 N 和最多 2 個 Si 原子的環員是可選的，因為雜原子環員數可以為零。 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ 的定義允許具有最多 2 個硫環員，其可以是氧化的硫部分（如 $S(=O)$ 或 $S(=O)_2$ ）或未氧化的硫原子（即 s 和 f 均為零時）。可以將氮原子環員氧化成 N -氧化物，因為與式 1 相關的化合物也包括 N -氧化物衍生物。選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ 的最多 2 個碳原子環員加在選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 2 個 N 和最多 2 個 Si 原子的最多 4 個雜原子上。這些任選的取代基（當存在時）連接至可用的碳原子和

氮原子環員並連接在由 R¹⁶ and R¹⁹ 所提供的環部分。矽原子環員上的取代基被分別定義為 R⁹ 和 R¹⁰。

式 1 化合物可以作為一種或多種立體異構體存在。多種立體異構體包括鏡像異構物、非鏡像異構物、阻轉異構體和幾何異構體。本領域技術人員將會知道，一種立體異構體在相對於其他立體異構體富集時或在與其他立體異構體分離時，可更具有活性和/或可顯示出有益效應。另外，技術人員知道如何去分離、富集和/或選擇性地製備所述立體異構體。式 1 化合物可以作為立體異構體的混合物、單種的立體異構體存在，或以旋光形式存在。例如，當 J 為在 3-位置鍵合至式 1 的其餘部分的 J-29 (參見示例 3) 並且 J-29 在 5-位置具有一個 R⁶ 取代基而不是 H 時，式 1 在與 R⁶ 鍵合的碳原子處具有一個手性中心。描述了如下式 1' 和式 1'' 兩種鏡像異構物並且其手性中心用星號(*)標識。



式 1 化合物包括外消旋的混合物，例如等量的式 1' 和式 1'' 鏡像異構物。另外，式 1 化合物還包括與外消旋混合物相比較富集有式 1 的鏡像異構物的化合物。另外還包括基本上純的式 1 化合物的鏡像異構物，例如式 1' 和式 1''。

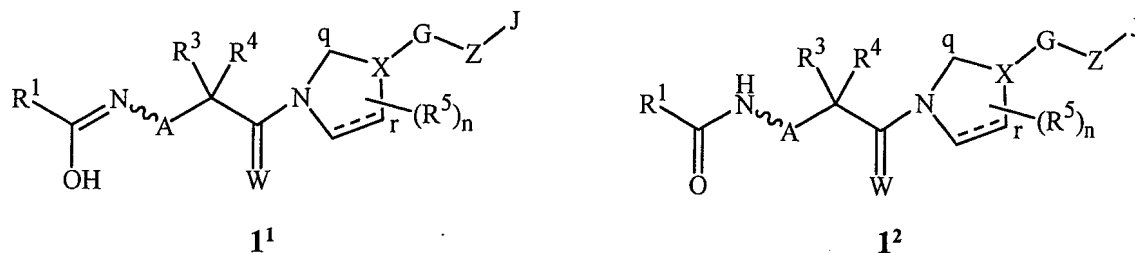
當富集鏡像異構物時，一種鏡像異構物會以大於其他鏡像異構物的量存在，並且富集程度可用鏡像異構物過量(「ee」)來限定，鏡像異構物過量被定義為 $(2x-1) \cdot 100\%$ ，其中 x 為混合物中佔優勢的鏡像異構物的莫耳分數(例如，ee為20%對應於60:40的鏡像異構物比率)。

較佳地，本發明的式1組合物具有至少50%鏡像異構物過量；更佳至少75%鏡像異構物過量；更佳至少90%鏡像異構物過量；並且最佳至少94%鏡像異構物過量的更具活性的異構體。特別值得注意的是對映異構體純的更具活性的異構體的實施例。

式1化合物可具有另外的手性中心。例如，取代基和其他的分子組成如A、 R^3 、 R^4 、 R^6 、 R^{6a} 、G、J、Q、 X^1 至 X^9 、Z、 Z^2 和 Z^3 可本身含有手性中心。在這些另外的手性中心處式1化合物包含外消旋混合物以及富集且基本上純的立體構型。

式1化合物可以因式1中醯胺鍵(如C(=W)-N)的旋轉受限而作為一種或多種構象異構體存在。式1化合物包含構象異構體的混合物。像另外，式1化合物包括一種構象異構體相對於其他構象異構體富集的化合物。

本領域技術人員將認識到，式1化合物可與一種或多種它們各自的互變異構對應物平衡共存。除非另外指明，否則通過對一種互變異構體的描述來提及化合物可認為是包括所有互變異構體。例如，當式1中的 R^2 為羥基時，則提及式1¹描述的互變異構形式還包括式1²描述的互變異構形式。



另外，在示例 1、2、3 和 4 中描述的某些不飽和的環和環系統可在環員之間具有與所描述的不同的單鍵和雙鍵排列。這種針對特定環原子排列的不同鍵排列對應不同的互變異構體。對於這些不飽和的環和環系統而言，所描述的特定互變異構體被認為是代表對所示環原子的排列來說可能的所有互變異構體。

本發明的化合物包括式 1 的 *N*-氧化物衍生物。本領域技術人員將會知道，並不是所有含氮的雜環都可形成 *N*-氧化物，因為氮需要可用的孤電子對來氧化成氧化物；本領域技術人員將知道可形成 *N*-氧化物的那些含氮雜環。本領域技術人員還知道三級胺可形成 *N*-氧化物。用於製備雜環和三級胺的 *N*-氧化物的合成方法是本領域技術人員所熟知的，包括用如下物質氧化雜環和三級胺：過氧酸如過氧乙酸和間-氯過苯甲酸 (MCPBA)、過氧化氫、烷基氫過氧化物如三級-丁基氫過氧化物、過硼酸鈉和雙環氧乙烷如二甲基雙環氧乙烷。用於製備 *N*-氧化物的這些方法已在文獻中有充分描述和評論，參見例如：T. L. Gilchrist, *Comprehensive Organic Synthesis*, 第 7 卷, 第 748-750 頁, S. V. Ley (編輯), Pergamon Press; M. Tisler 和 B. Stanovnik,

Comprehensive Heterocyclic Chemistry, 第 3 卷, 第 18-20 頁, A. J. Boulton 和 A. McKillop(編輯), Pergamon Press; M. R. Grimmett 和 B. R. T. Keene, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, 第 43 卷, 第 149-161 頁, A. R. Katritzky (編輯), Academic Press; M. Tisler 和 B. Stanovnik, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, 第 9 卷, 第 285-291 頁, A. R. Katritzky 和 A. J. Boulton (編輯), Academic Press; 以及 G. W. H. Cheeseman 和 E. S. g. Werstiuk, *Advances in Heterocyclic Chemistry*, 第 22 卷, 第 390-392 頁, A. R. Katritzky 和 A. J. Boulton (編輯), Academic Press。

本領域技術人員會認識到, 因為在環境中和生理條件下, 化合物的鹽可與它們相應的非鹽形式存在平衡, 所以鹽與非鹽形式同具有生物學效用。當形成本發明混合物和組合物的化合物含有酸性部分或鹼性部分時, 可形成各種鹽, 並且這些鹽可用於本發明混合物和組合物中以控制由真菌植物病原體引起的植物疾病(即是在農業上合適的)。當化合物含有諸如胺官能之類的鹼性部分時, 鹽包括與無機酸或有機酸例如氫溴酸、鹽酸、硝酸、磷酸、硫酸、乙酸、丁酸、富馬酸、乳酸、馬來酸、丙二酸、草酸、丙酸、水楊酸、酒石酸、4-甲苯磺酸或戊酸的酸加成鹽。當化合物含有諸如羧酸或酚之類的酸性部分時, 鹽包括與有機鹼或無機鹼(例如吡啶、三乙胺或氨、醯胺或鈉、鉀、鋰、鈣、鎂或鋇的氫化物或氫氧化物或碳酸鹽)形成的那些。

選自式 1 的化合物、其立體異構體、互變異構體、*N*-氧化物及鹽，通常以不止一種形式存在，式 1 因而包括式 1 表示的化合物的所有晶體形式和非晶體形式。非晶體形式包括為諸如蠟和膠之類的固體的實施例以及為諸如溶液和熔體之類的液體的實施例。晶體形式包括基本代表單種晶體類型的實施例和代表多晶型物混合物（即不同的晶體類型）的實施例。術語「多晶型物」指可結晶成不同晶體形式的化合物的特定晶體形式，這些形式的晶格內的分子具有不同的排列和/或構象。儘管多晶型物可具有相同的化學組成，但它們也可因為存在或不存在共結晶水或其他分子（其可以弱作用力或強作用力結合在晶格中）而在組成上不同。多晶型物可在諸如晶體形狀、密度、硬度、顏色、化學穩定性、熔點、吸濕性、可懸浮性、溶解速率和生物利用度之類的化學、物理和生物學性質方面不同。本領域技術人員將會知道，式 1 表示的化合物的多晶型物相對於式 1 表示的相同化合物的其他多晶型物或多晶型物混合物，可顯示具有有益效果（如，製備有用製劑的適應性、改善的生物學性能）。式 1 表示的化合物的特定多晶型物的製備和分離可通過本領域技術人員已知的方法（包括例如使用選擇的溶劑和溫度進行結晶）來實現。

「發明內容」中所描述的本發明實施例包括下面描述的那些。在下面的實施例中，式 1 包括它們的幾何異構體和立體異構體、互變異構體、*N*-氧化物及其鹽，並且提及「式 1 化合物」包括「發明內容」中所說明的取代基的定義，除非在實施例中進行了另外定義。

實施例 1. 其中 A 為 -O-、-S-、-N(R⁷)- 或 -OC(R⁸)₂- 的式 1 化合物。

實施例 1a. 其中每個 R⁸ 為 H 的式 1 或實施例 1 化合物。

實施例 1b. 其中 A 為 -O-、-S- 或 -N(R⁷)- 的實施例 1 化合物。

實施例 2. 其中 A 為 -O- 或 -N(R⁷)- 的實施例 1b 的化合物。

實施例 3. 其中 A 為 -N(R⁷)- 的實施例 2 的化合物。

實施例 3a. 其中 A 為 -O- 的實施例 2 的化合物。

實施例 4. 式 1 或實施例 1 至 3 中任一者的化合物，其中 R⁷ 在單獨出現時（即沒有與 R² 一起）為 H、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基、CH₃C(=O)、CF₃C(=O) 或 CH₃OC(=O)。

實施例 5. 實施例 4 的化合物，其中 R⁷ 在單獨出現時為 H 或 C₁-C₂ 烷基。

實施例 5a. 實施例 5 的化合物，其中 R⁷ 在單獨出現時為 H 或甲基。

實施例 5b. 式 1 或實施例 1 至 5a 中任一者的化合物，其中 R⁷ 單獨出現。

實施例 6. 式 1 或實施例 1 至 5b 中任一者的化合物，其中 W 為 O。

實施例 7. 式 1 或實施例 1 至 6 中任一者的化合物，其中 X 為 X¹、X²、X³、X⁴、X⁵、X⁶、X⁷ 或 X⁸。

實施例 8. 實施例 7 的化合物，其中 X 為 X^1 、 X^2 或 X^3 。

實施例 9. 實施例 8 的化合物，其中 X 為 X^1 或 X^2 。

實施例 10. 實施例 9 的化合物，其中 X 為 X^1 。

實施例 11. 式 1 或實施例 1 至 10 中任一者的化合物，其中具有 X 的環是不飽和的。

實施例 12. 式 1 或實施例 1 至 11 中任一者的化合物，其中 Z 為直接鍵、 $\text{CH}(\text{R}^{12})$ 或 $\text{N}(\text{R}^{13})$ 。

實施例 13. 實施例 12 的化合物，其中 Z 為直接鍵。

實施例 14. 式 1 或實施例 1 至 12 中任一者的化合物，其中每個 R^{13} 獨立為 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烷基羰基或 C_2 - C_3 烷氧基羰基。

實施例 15. 式 1 或實施例 1 至 14 中任一者的化合物，其中

每個 R^5 獨立地為鹵素、氰基、羥基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基或 C_1 - C_2 烷氧基；或者

兩個 R^5 基團合在一起為 C_1 - C_3 伸烷基或 C_2 - C_3 伸烯基，以形成橋聯雙環系統；或者

與由雙鍵接合的相鄰環碳原子結合的兩個 R^5 基團合在一起為 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ ，該 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ 任選經最多 2 個獨立選自鹵素、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_4 鹵烷基和 C_1 - C_4 烷氧基的取代基取代。

實施例 16. 實施例 15 的化合物，其中每個 R^5 獨立地為鹵素、氰基、羥基、 C_1 - C_4 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基或 C_1 - C_2 烷氧基。

實施例 17. 實施例 16 的化合物，其中每個 R^5 獨立地為鹵素、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基或 C_1 - C_2 烷氧基。

實施例 18. 實施例 17 的化合物，其中每個 R^5 獨立地為氰基、甲基或甲氧基。

實施例 19. 實施例 18 的化合物，其中每個 R^5 為甲基。

實施例 20. 式 1 或實施例 1 至 19 中任一者的化合物，其中 n 為 0 或 1。

實施例 21. 實施例 20 的化合物，其中 n 為 0。

實施例 22. 式 1 或實施例 1 至 21 中任一者的化合物，其中 R^1 在單獨出現時（即沒有與 R^2 一起時）為 H、氰基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 鹵烯基、 C_2 - C_4 鹵炔基、 C_2 - C_4 烷氧基烷基、 C_2 - C_4 烷硫基烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_4 烯氧基、 C_2 - C_4 鹵烯氧基、 C_2 - C_4 炔氧基、 C_3 - C_4 鹵炔氧基、 C_2 - C_4 烷氧基烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 烷基胺基、 C_2 - C_4 二烷基胺基、 C_1 - C_4 鹵烷基胺基或 C_2 - C_4 鹵二烷基胺基。

實施例 23. 實施例 22 的化合物，其中 R^1 在單獨出現時為 H、氰基、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烯基、 C_2 - C_3 炔基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_2 - C_3 鹵烯基、 C_2 - C_3 鹵炔基、 C_1 - C_3 烷氧基或 C_1 - C_3 鹵烷氧基。

實施例 24. 實施例 23 的化合物，其中 R^1 在單獨出現時為 H、 C_1 - C_3 烷基或 C_1 - C_3 鹵烷基。

實施例 25. 實施例 24 的化合物，其中 R^1 在單獨出現時為 H、 C_1 - C_3 烷基或 C_1 - C_3 氟烷基。

實施例 26. 實施例 25 的化合物，其中 R^1 在單獨出現時為 H、甲基、三氟甲基或 CF_3CH_2 。

實施例 26a. 實施例 26 的化合物，其中 R^1 在單獨出現時為甲基、三氟甲基或 CF_3CH_2 。

實施例 26a. 式 1 或實施例 1 至 26 中任一者的化合物，其中 R^1 單獨出現。

實施例 27. 式 1 或實施例 1 至 26a 中任一者的化合物，其中 R^2 在單獨出現時（即沒有與 R^1 或 R^7 一起）為 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 烷氧基或 C_1 - C_3 鹵烷基。

實施例 28. 實施例 27 的化合物，其中 R^2 在單獨出現時為 H、 C_1 - C_3 烷基或 C_1 - C_3 鹵烷基。

實施例 29. 實施例 28 的化合物，其中 R^2 在單獨出現時為 H、 C_1 - C_2 烷基或 C_1 - C_3 氟烷基。

實施例 29a. 實施例 29 的化合物，其中 R^2 在單獨出現時為 H、甲基或三氟甲基。

實施例 29b. 式 1 或實施例 1 至 29a 中任一者的化合物，其中 R^2 單獨出現。

實施例 30. 式 1 或實施例 1 至 29b 中任一者的化合物，其中當 R^1 和 R^2 與它們連接的碳原子一起形成環時，該環具有選自碳原子和最多 2 個雜原子的 3-至 6-員，所述雜原子獨立選自最多 2

個 O、最多 2 個 S 和最多 2 個 N，其中最多 1 個碳原子環員為 C(=O)或 C(=S)並且該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₁-C₂ 烷氧基和 C₁-C₂ 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 烷氧基的取代基取代。

實施例 30a. 實施例 30 的化合物，其中 R¹ 和 R² 與它們連接的碳原子一起形成實施例 30 中所定義的環。

實施例 31. 式 1 或實施例 1 至 30a 中任一者的化合物，其中當 R² 和 R⁷ 與它們連接的相連原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環時，除了相連原子外所述環還含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，該環任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₁-C₂ 烷氧基和 C₁-C₂ 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 烷氧基的取代基取代。

實施例 31a. 實施例 31 的化合物，其中 R² 和 R⁷ 與它們連接的相連原子一起形成實施例 31 中所定義的環。

實施例 32. 實施例 31 的化合物，其中當 R² 和 R⁷ 與它們連接的相連原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環時，除了相連原子外所述環還含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述雜原

子獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，並且該環的碳環原子上任選經最多 2 個獨立選自鹵素和 C₁-C₂ 烷基的取代基取代。

實施例 32a. 實施例 32 的化合物，其中 R² 和 R⁷ 與它們連接的相連原子一起形成實施例 32 中所定義的環。

實施例 32b. 實施例 32 的化合物，其中 R² 和 R⁷ 與它們連接的相連原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環時，除了相連原子外所述環還含有選自碳原子的環員，該環係任選經最多 2 個獨立選自 C₁-C₂ 烷基的取代基取代。

實施例 32c. 實施例 32b 的化合物，其中 R² 和 R⁷ 與它們連接的相連原子一起形成實施例 32b 中所定義的環。

實施例 33. 式 1 或實施例 1 至 32a 中任一者的化合物，其中 R³ 為經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環；或 H、氰基、羥基、C₁-C₃ 烷基、C₂-C₃ 烯基、C₂-C₃ 炔基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₂-C₃ 鹵烯基、C₂-C₃ 鹵炔基、C₂-C₃ 烷基羰基、C₂-C₃ 鹵烷基羰基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基、C₁-C₃ 烷硫基、C₁-C₃ 鹵烷硫基、C₂-C₃ 烷基羰基氧基或 C₂-C₃ 鹵烷基羰基氧基。

實施例 34. 實施例 33 的化合物，其中 R³ 為 H、氰基、羥基、C₁-C₃ 烷基、C₂-C₃ 烯基、C₂-C₃ 炔基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₂-C₃ 鹵烯基、C₂-C₃ 鹵炔

基、C₂-C₃ 烷基羰基、C₂-C₃ 鹵烷基羰基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基、C₁-C₃ 烷硫基、C₁-C₃ 鹵烷硫基、C₂-C₃ 烷基羰基氧基或 C₂-C₃ 鹵烷基羰基氧基。

實施例 35. 實施例 34 的化合物，其中 R³ 為 H、氘基、羥基、C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基、C₁-C₃ 烷硫基、C₁-C₃ 鹵烷硫基、C₂-C₃ 烷基羰基氧基或 C₂-C₃ 鹵烷基羰基氧基。

實施例 36. 實施例 35 的化合物，其中 R³ 為 H、氘基、甲基、甲氧基或 CH₃C(=O)O⁻。

實施例 37. 實施例 36 的化合物，其中 R³ 為 H 或甲基。

實施例 37a. 實施例 37 的化合物，其中 R³ 為 H。

實施例 38. 式 1 或實施例 1 至 33 中任一者的化合物，其中當 R³ 為經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環時，所述經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環是經最多 3 個可選的取代基取代。

實施例 38a. 實施例 38 的化合物，其中當 R³ 為經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環時，所述經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環是經最多 2 個可選的取代基取代。

實施例 38b. 式 1 或實施例 1 至 38a 中任一者的化合物，其中當 R^3 為經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環時，則苯基、萘基或 5-至 6-員雜芳環上的可選取代基獨立選自碳原子環員上的 R^{25a} 和氮原子環員上的 R^{25b} ；

每個 R^{25a} 獨立地為鹵素、氰基、羥基、胺基、硝基、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷基、 C_4 - C_{10} 烷基環烷基、 C_5 - C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 烷基磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷基磺醯基、 C_1 - C_4 鹵烷基胺基、 C_2 - C_8 二烷基胺基、 C_3 - C_6 環烷基胺基、 C_2 - C_4 烷氧基烷基、 C_1 - C_4 羥烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_6 烷氧基羰基、 C_2 - C_6 烷基羰基氧基、 C_2 - C_6 烷基羰硫基、 C_2 - C_6 烷基胺基羰基、 C_3 - C_8 二烷基胺基羰基或 C_3 - C_6 三烷基矽烷基；並且

每個 R^{25b} 獨立地為 C_1 - C_6 烷基、 C_3 - C_6 烯基、 C_3 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_3 - C_6 鹵烯基、 C_3 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 鹵環烷基或 C_2 - C_4 烷氧基烷基。

實施例 39. 實施例 38b 的化合物，其中每個 R^{25a} 獨立地為鹵素、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基或 C_1 - C_2 烷氧基。

實施例 40. 實施例 39 的化合物，其中每個 R^{25a} 獨立地為 Cl、Br、I、 C_1 - C_2 烷基、三氟甲基或甲氧基。

實施例 41. 實施例 40 的化合物，其中每個 R^{25a} 獨立地為 Cl、Br、 C_1 - C_2 烷基或三氟甲基。

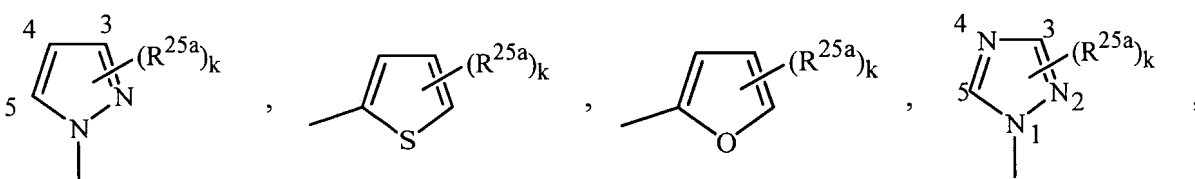
實施例 41a. 實施例 38b 的化合物，其中每個 R^{25b} 獨立地為 C_1 - C_2 烷基、環丙基或 C_2 - C_4 烷氧基烷基。

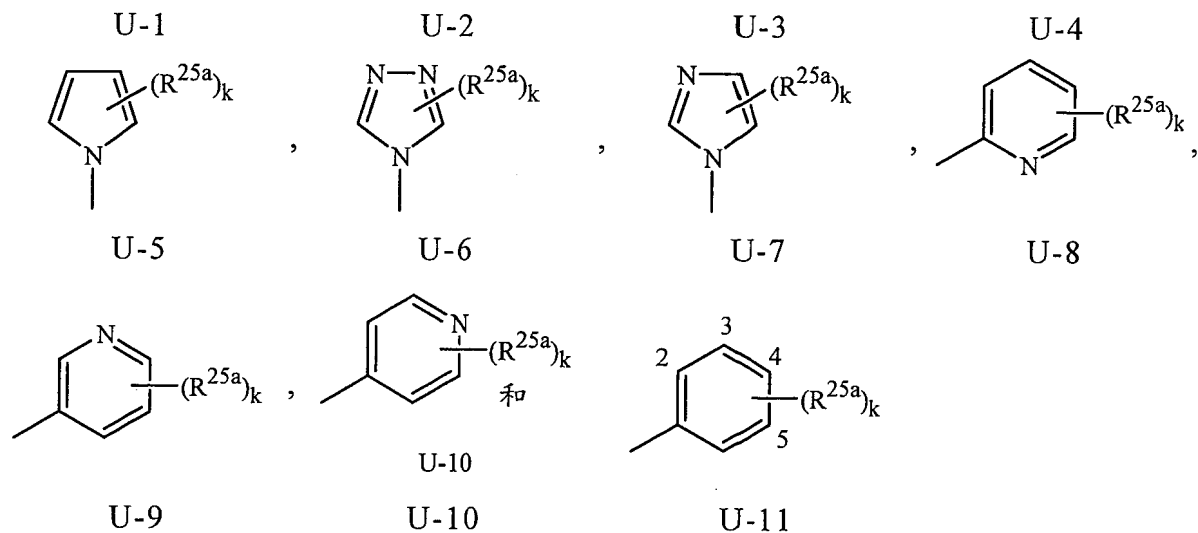
實施例 41b. 實施例 41a 的化合物，其中每個 R^{25b} 為甲基。

實施例 42. 式 1 或實施例 1 至 41 中任一者的化合物，其中當 R^3 是經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或一經任選取代的 5-至 6-員雜芳環時，則 R^3 不是經任選取代的萘基。

實施例 43. 式 1 或實施例 1 至 42 中任一者的化合物，其中當 R^3 為經任選取代的苯基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環時，則 R^3 選自示例 1 中的 U-1 至 U-11。

示例 1





其中向左伸出的鍵連接至式 1；且 k 為 0、1 或 2。

實施例 44. 實施例 43 的化合物，其中 R^3 選自 U-1、U-4 與 U-11。

實施例 45. 實施例 44 的化合物，其中 R^3 為 U-1。

實施例 45a. 實施例 33 至 45 任何其中之一之化合物，其中當 R^3 是經任選取代的苯基或一經任選取代的 5-至 6-員雜芳環時，則 R^3 選自 U-1 至 U-11；或者當 R^3 為 H、氰基、羥基、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烯基、 C_2 - C_3 炔基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_2 - C_3 鹵烯基、 C_2 - C_3 鹵炔基、 C_2 - C_3 烷基羰基、 C_2 - C_3 鹵烷基羰基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 鹵烷氧基、 C_1 - C_3 烷硫基、 C_1 - C_3 鹵烷硫基、 C_2 - C_3 烷基羰基氧基或 C_2 - C_3 鹵烷基羰基氧基，則 R^3 選自 H、氰基、羥基、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 鹵烷氧基、 C_1 - C_3 烷硫基、 C_1 - C_3 鹵烷硫基、 C_2 - C_3 烷基羰基氧基或 C_2 - C_3 鹵烷基羰基氧基。

實施例 46. 式 1 或實施例 1 至 45a 中任一者的化合物，其中 R^4 為 H 或 C_1-C_2 烷基。

實施例 47. 實施例 46 的化合物，其中 R^4 為 H。

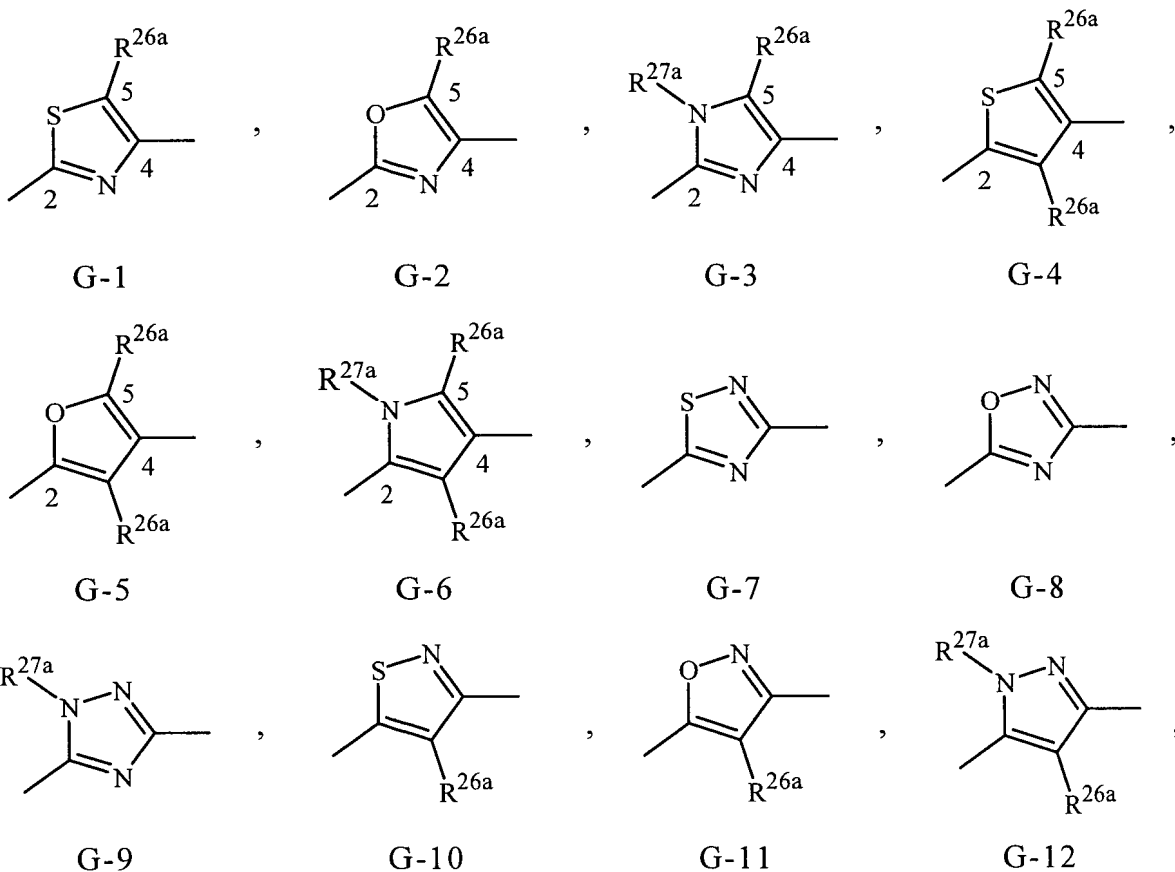
實施例 48. 式 1 或實施例 1 至 47 中任一者的化合物，其中 G 為 5 員雜環，任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的 R^{26} 和氮原子環員上的 R^{27} 的取代基取代；

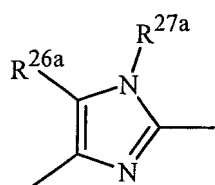
每個 R^{26} 獨立地為鹵素、 C_1-C_3 烷基或 C_1-C_3 鹵烷基；並且

每個 R^{27} 獨立地為 C_1-C_3 烷基。

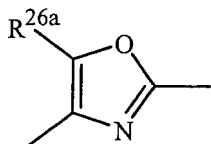
實施例 49. 實施例 48 的化合物，其中 G 為選自示例 2 中 G-1 至 G-59 的 5 員雜環。

示例 2

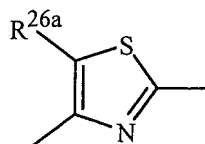




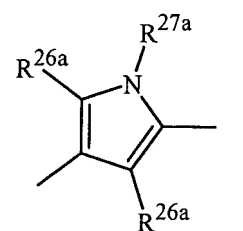
G-13



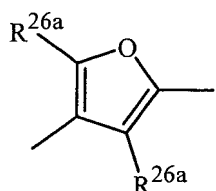
G-14



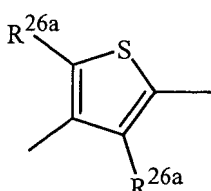
G-15



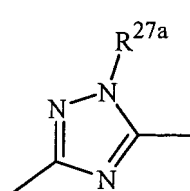
G-16



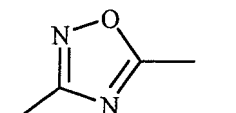
G-17



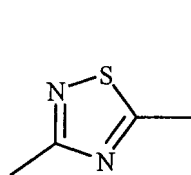
G-18



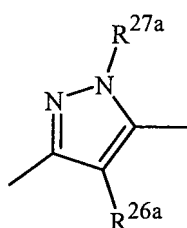
G-19



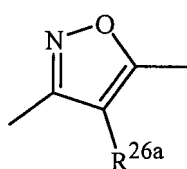
G-20



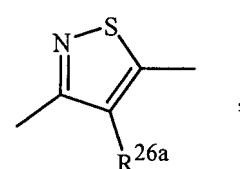
G-21



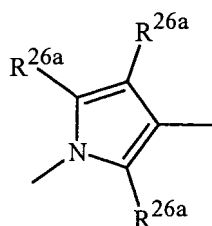
G-22



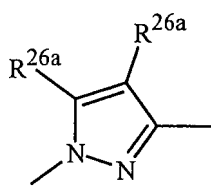
G-23



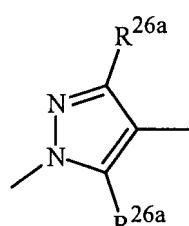
G-24



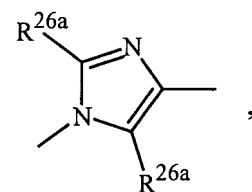
G-25



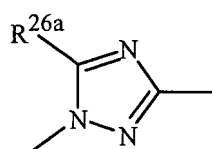
G-26



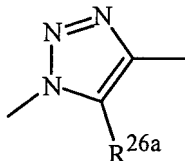
G-27



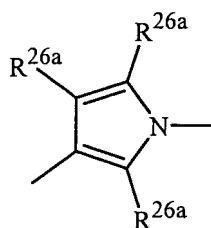
G-28



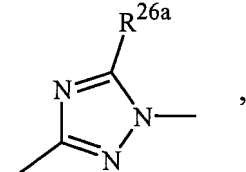
G-29



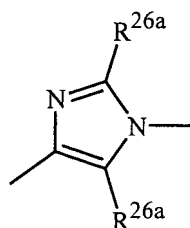
G-30



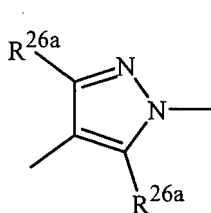
G-31



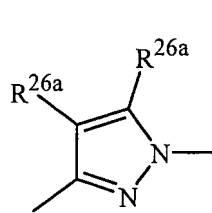
G-32



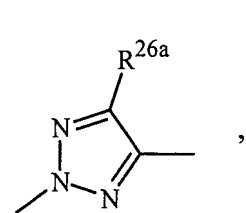
G-33



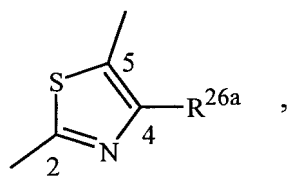
G-34



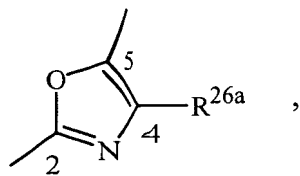
G-35



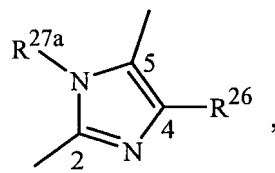
G-36



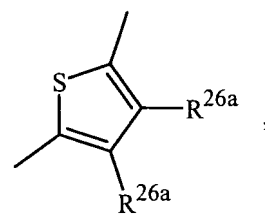
G-37



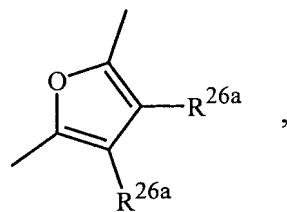
G-38



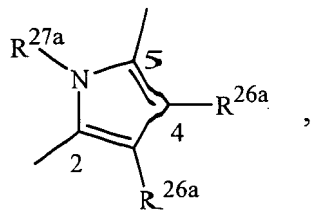
G-39



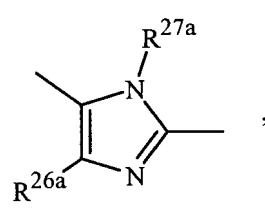
G-40



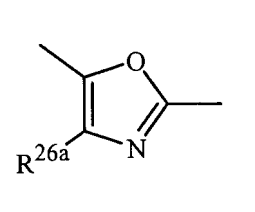
G-41



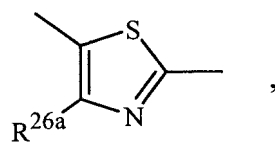
G-42



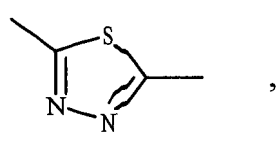
G-43



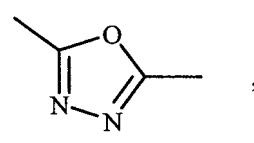
G-44



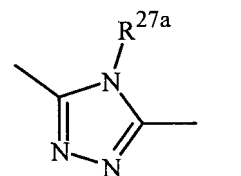
G-45



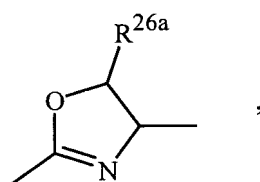
G-46



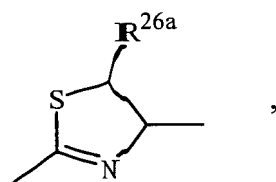
G-47



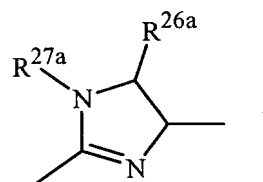
G-48



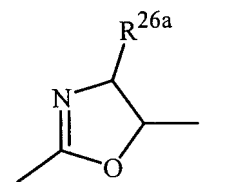
G-49



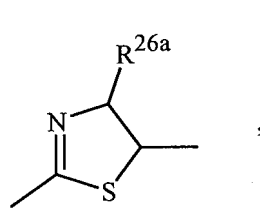
G-50



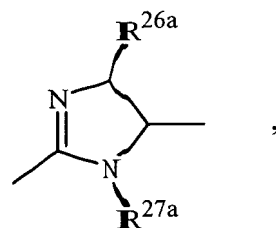
G-51



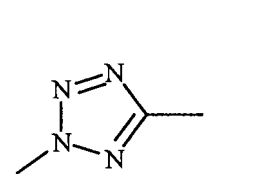
G-52



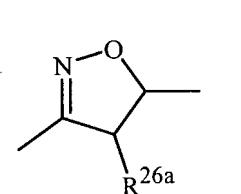
G-53



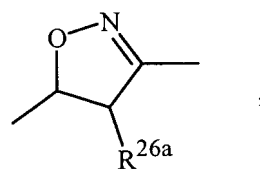
G-54



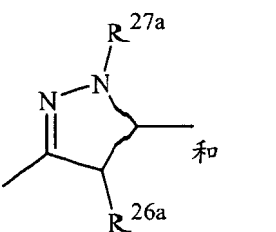
G-55



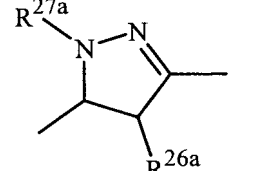
G-56



G-57



G-58



G-59

其中向左伸出的鍵連接至 X，而向右伸出的鍵連接至式 1 中的 Z；每個 R^{26a} 獨立選自 H 和 R^{26} ；而 R^{27a} 選自 H 和 R^{27} 。

實施例 50. 實施例 49 的化合物，其中 G 選自 G-1 至 G-3、G-7、G-8、G-10、G-11、G-14、G-15、G-23、G-24、G-26 至 G-28、G-30、G-36 至 G-38 和 G-49 至 G-55。

實施例 51. 實施例 50 的化合物，其中 G 選自 G-1、G-2、G-7、G-8、G-14、G-15、G-23、G-24、G-26、G-27、G-36、G-37、G-38、G-49、G-50 和 G-55。

實施例 52. 實施例 51 的化合物，其中 G 選自 G-1、G-2、G-15、G-26、G-27、G-36、G-37 和 G-38。

實施例 53. 實施例 52 的化合物，其中 G 選自 G-1、G-2、G-15、G-26 和 G-36。

實施例 54. 實施例 53 的化合物，其中 G 為 G-1。

實施例 55. 實施例 53 的化合物，其中 G 為 G-2。

實施例 56. 實施例 53 的化合物，其中 G 為 G-15。

實施例 57. 實施例 53 的化合物，其中 G 為 G-26。

實施例 58. 實施例 53 的化合物，其中 G 為 G-36。

實施例 59. 實施例 49 至 58 中任一者的化合物，其中每個 R^{26a} 獨立地為 H、鹵素或 C_1 - C_3 烷基。

實施例 60. 實施例 59 的化合物，其中每個 R^{26a} 獨立為 H 或甲基。

實施例 61. 實施例 60 的化合物，其中 R^{26a} 為 H。

實施例 62. 實施例 49 至 61 任一者中的化合物，其中每個 R^{27} 獨立為 H 或甲基。

實施例 62a. 實施例 62 的化合物，其中每個 R^{27a} 為 H。

實施例 62b. 式 1 或實施例 48 至 62a 中任一者的化合物，其中 G 為未被取代的雜環，它與 X 和 Z 的連接基除外。

實施例 63. 式 1 或實施例 1 至 62b 中任一者的化合物，其中 J 為 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 4 個 N，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，而硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，每個環或環系統任選經最多 5 個獨立選自 R^6 的取代基取代；或者當 Z 為直接鍵時，J 也為 $C(=W^2)NTATB$ 。

實施例 63a. 實施例 63 的化合物，其中 J 為 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 4 個 N，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，而硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，每個環或環系統經一 $-Z^2Q$ 取代基取代並且任選經最多 3

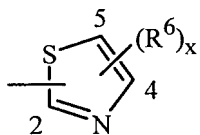
個獨立選自非- Z^2Q 的 R^6 取代基取代或者當 Z 為直接鍵時， J 也為 $C(=W^2)NTATB$ 。

實施例 63b. 實施例 63a 的化合物，其中 J 為 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 4 個 N，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，而硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，每個環或環系統經一- Z^2Q 取代基取代並且任選經 1 個獨立選自非- Z^2Q 的 R^6 取代基取代或者當 Z 為直接鍵時， J 也為 $C(=W^2)NTATB$ 。

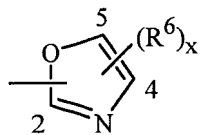
實施例 63c. 實施例 63 的化合物，其中 J 為 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 4 個 N，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，而硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，每個環或環系統經一- Z^2Q 取代基取代並且任選經 1 或 2 個獨立選自非- Z^2Q 的 R^6 取代基取代或者當 Z 為直接鍵時， J 也為 $C(=W^2)NTATB$ 。

實施例 64. 實施例 63 的化合物，其中當 J 不是 $C(=W^2)NTATB$ 時， J 為選自由示例 3 中 J-1 至 J-82 的環。

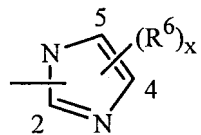
示例 3



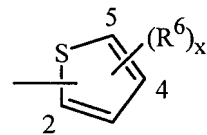
J-1



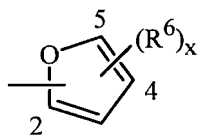
J-2



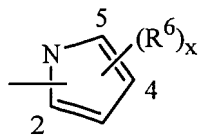
J-3



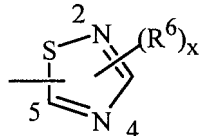
J-4



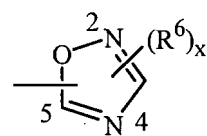
J-5



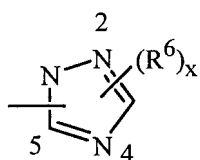
J-6



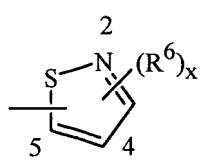
J-7



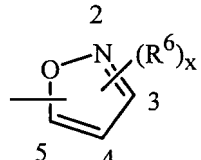
J-8



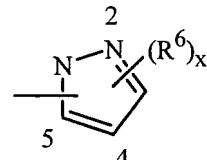
J-9



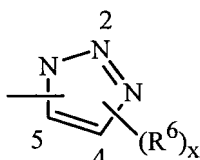
J-10



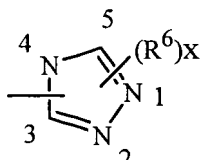
J-11



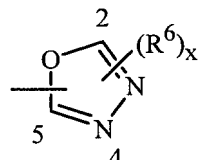
J-12



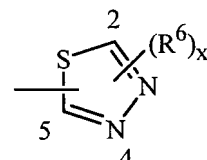
J-13



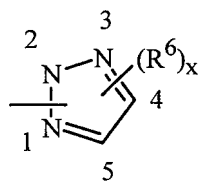
J-14



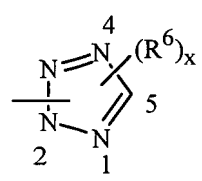
J-15



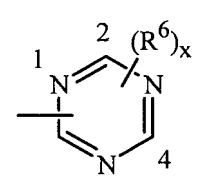
J-16



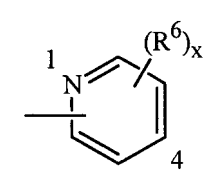
J-17



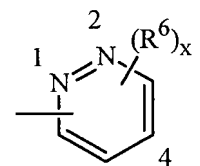
J-18



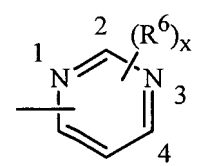
J-19



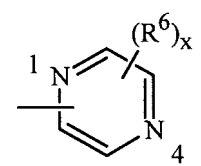
J-20



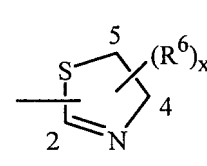
J-21



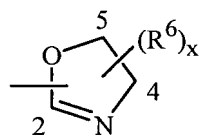
J-22



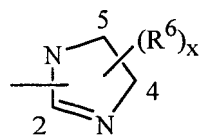
J-23



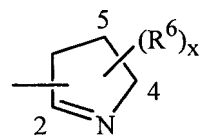
J-24



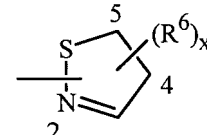
J-25



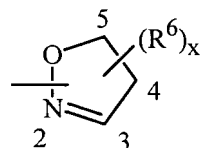
J-26



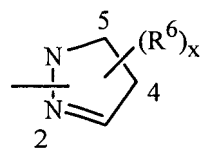
J-27



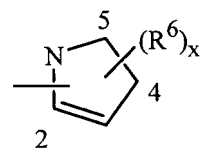
J-28



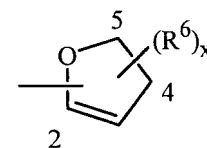
J-29



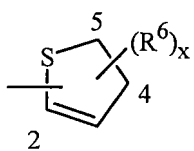
J-30



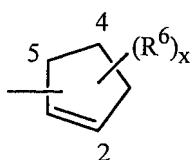
J-31



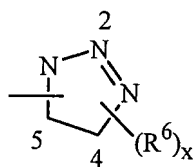
J-32



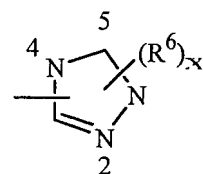
J-33



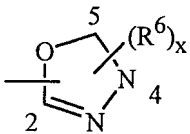
J-34



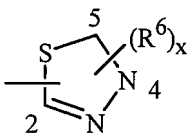
J-35



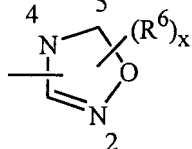
J-36



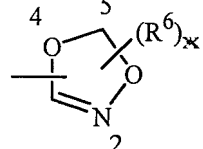
J-37



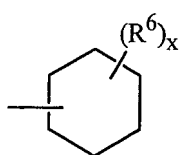
J-38



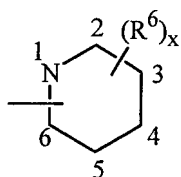
J-39



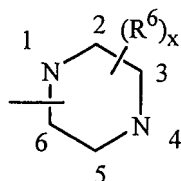
J-40



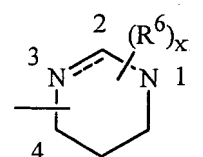
J-41



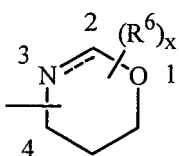
J-42



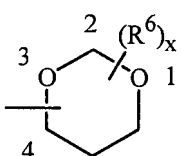
J-43



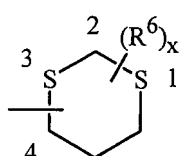
J-44



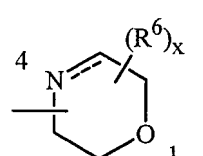
J-45



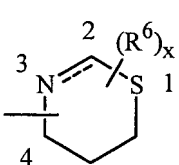
J-46



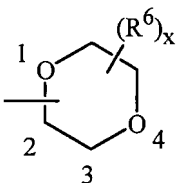
J-47



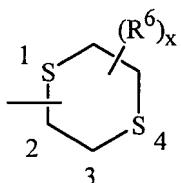
J-48



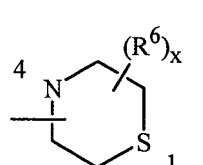
J-49



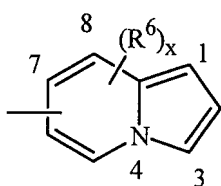
J-50



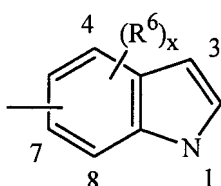
J-51



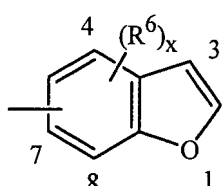
J-52



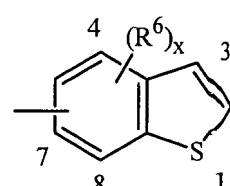
J-53



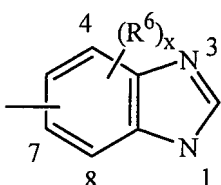
J-54



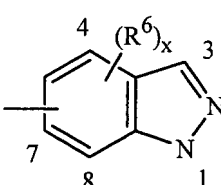
J-55



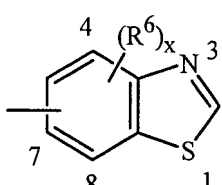
J-56



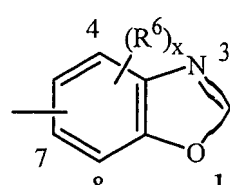
J-57



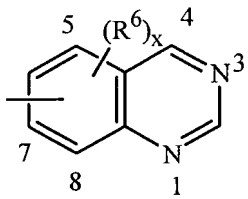
J-58



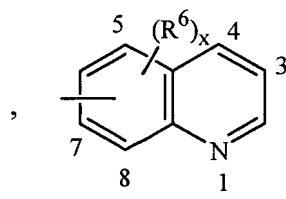
J-59



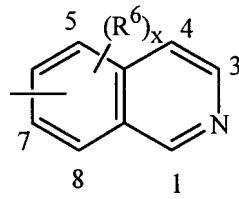
J-60



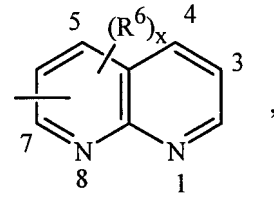
J-61



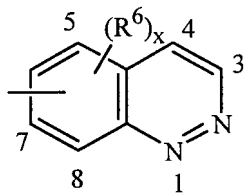
J-62



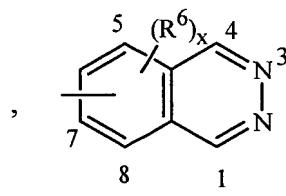
J-63



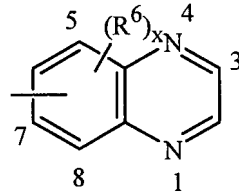
J-64



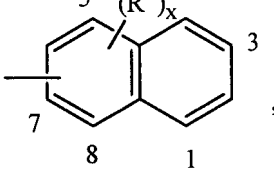
J-65



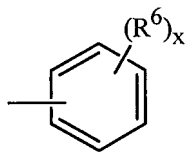
J-66



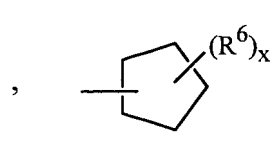
J-67



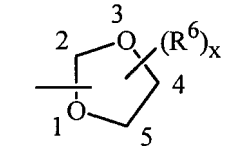
J-68



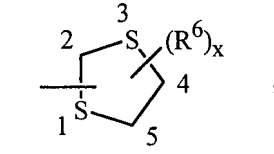
J-69



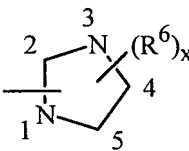
J-70



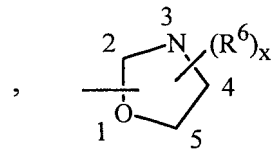
J-71



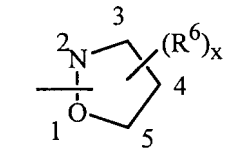
J-72



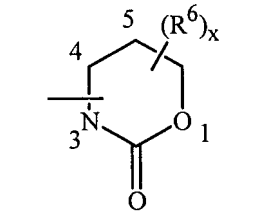
J-73



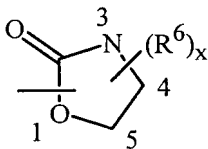
J-74



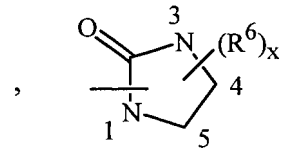
J-75



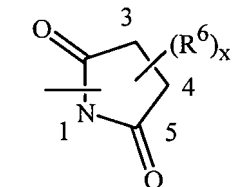
J-76



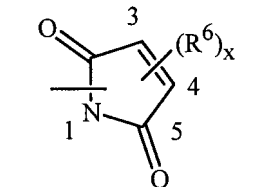
J-77



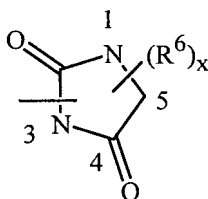
J-78



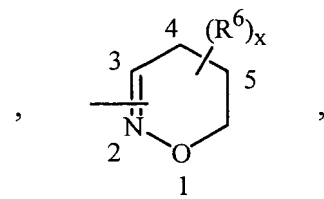
J-79



J-80



J-81



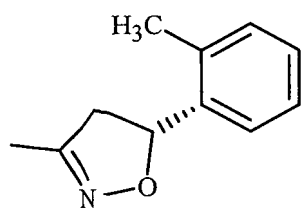
J-82

其中該浮動鍵透過所述環或環系統中的可用碳或氮原子環員連接至式 1 中的 Z；並且 X 為 0 至 5 的整數。

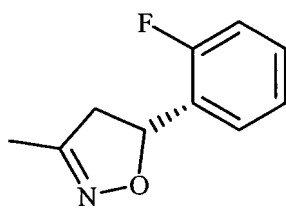
實施例 64a. 實施例 64 的化合物，其中 J 為選自 J-1 至 J-82 的環所組成的群組，X 為 1 至 5 的整數，而當 X 為 2、3、4 或 5 的整數時，則最多一 R⁶ 的例子為 -Z²Q。

實施例 65. 實施例 64 或 64a 的化合物，其中 J 為選自示例 A 中 J-29-1 至 J-29-60 的環。

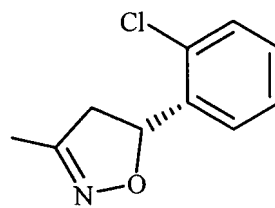
示例 A



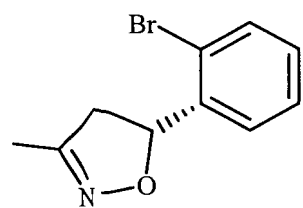
J-29-1



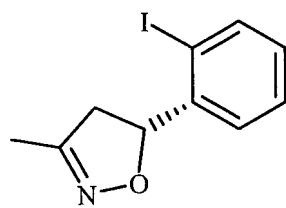
J-29-2



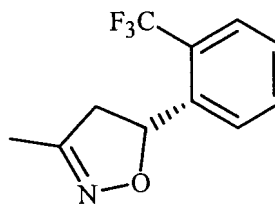
J-29-3



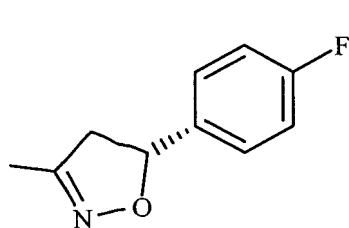
J-29-4



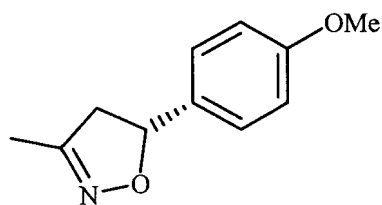
J-29-5



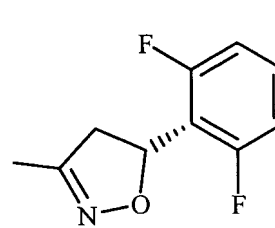
J-29-6



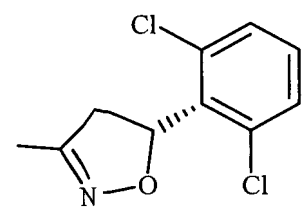
J-29-7



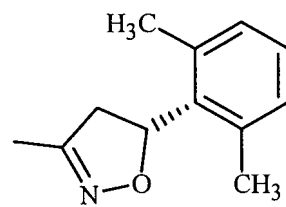
J-29-8



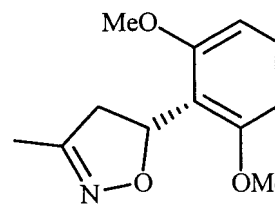
J-29-9



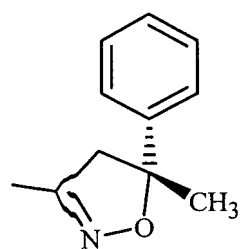
J-29-10



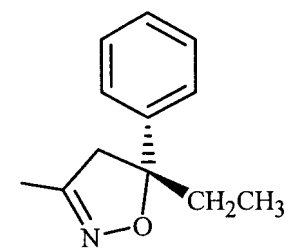
J-29-11



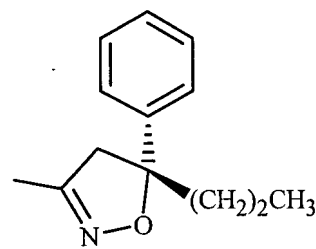
J-29-12



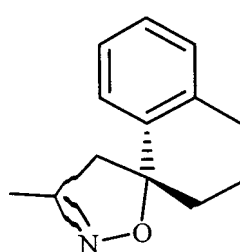
J-29-13



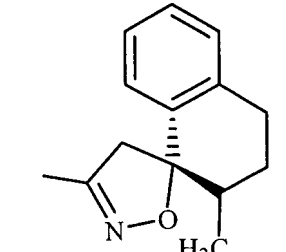
J-29-14



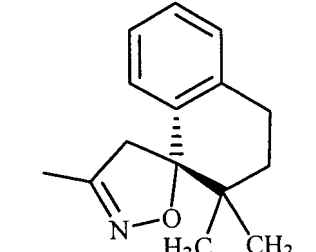
J-29-15



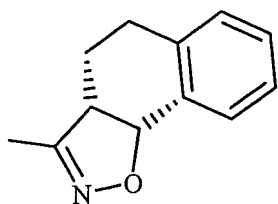
J-29-16



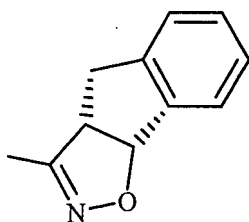
J-29-17



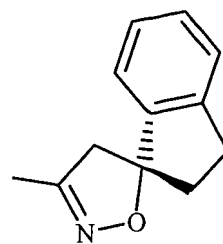
J-29-18



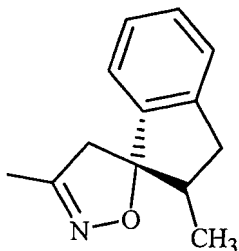
J-29-19



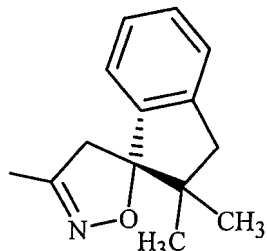
J-29-20



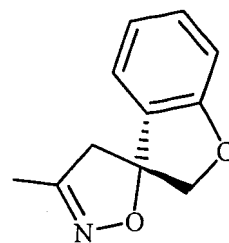
J-29-21



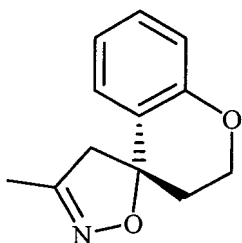
J-29-22



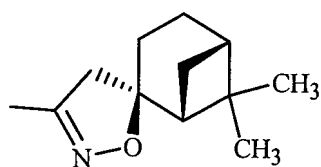
J-29-23



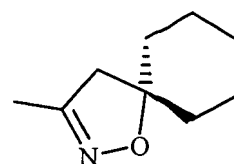
J-29-24



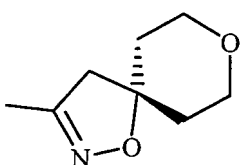
J-29-25



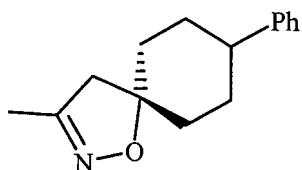
J-29-26



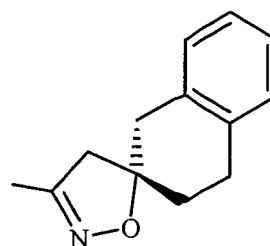
J-29-27



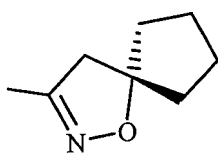
J-29-28



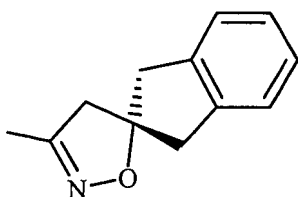
J-29-29



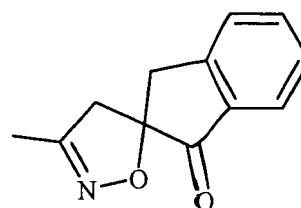
J-29-30



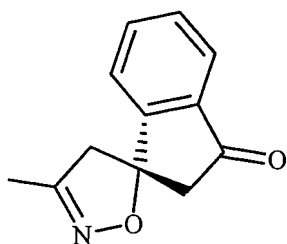
J-29-31



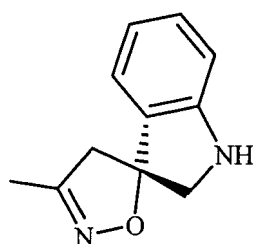
J-29-32



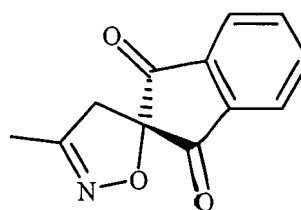
J-29-33



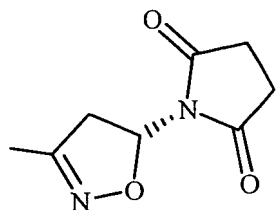
J-29-34



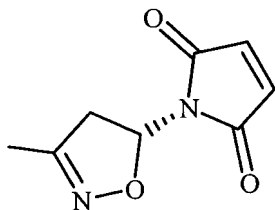
J-29-35



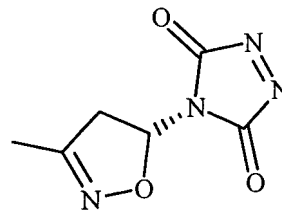
J-29-36



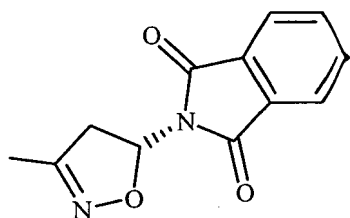
J-29-37



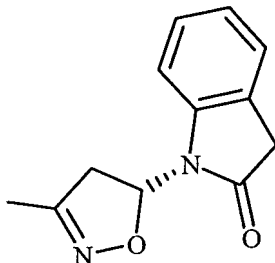
J-29-38



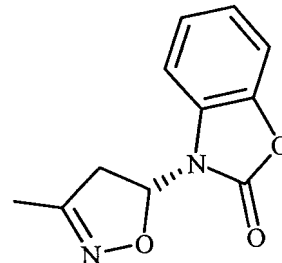
J-29-39



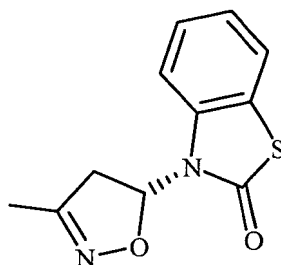
J-29-40



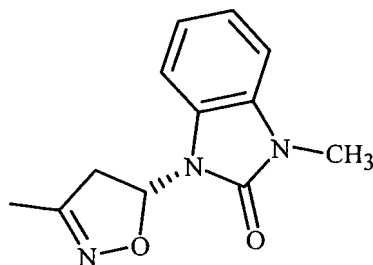
J-29-41



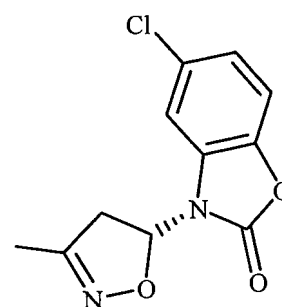
J-29-42



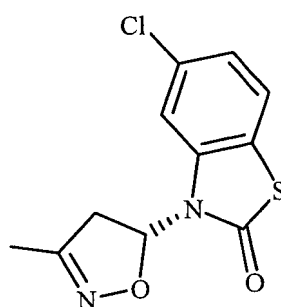
J-29-43



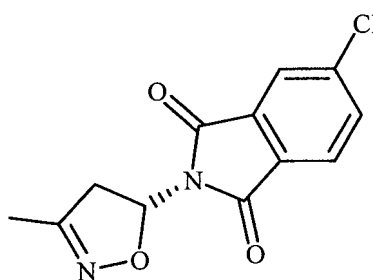
J-29-44



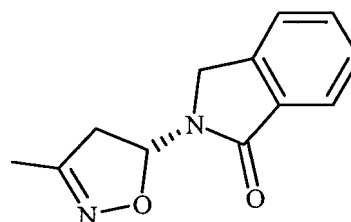
J-29-45



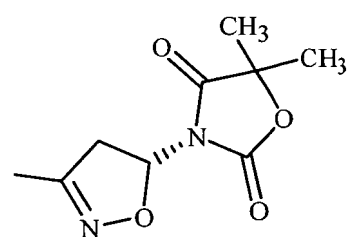
J-29-46



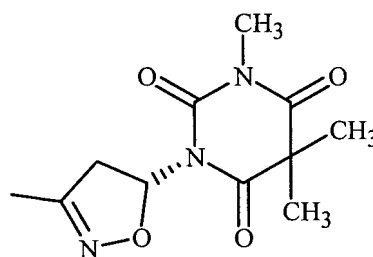
J-29-47



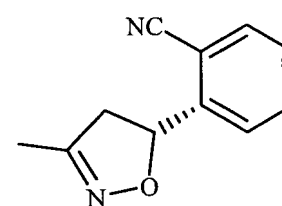
J-29-48



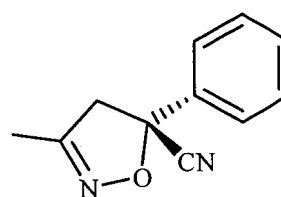
J-29-49



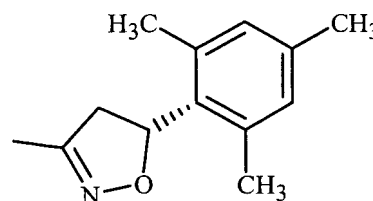
J-29-50



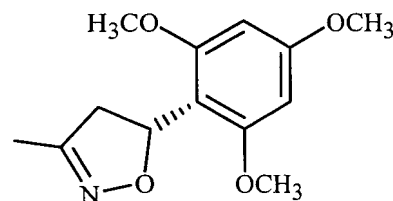
J-29-51



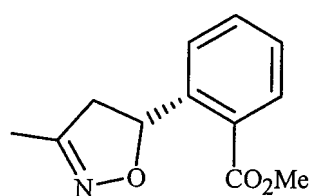
J-29-52



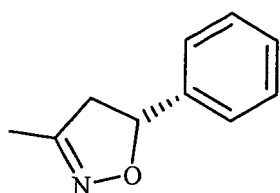
J-29-53



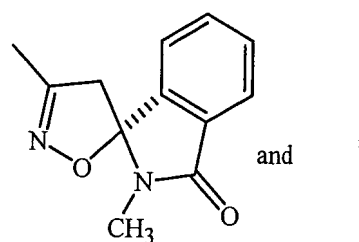
J-29-54



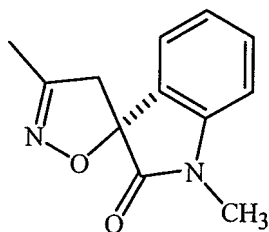
J-29-55



J-29-58



J-29-59



J-29-60

其中向左伸出的鍵連接至式 1 中的 Z。

實施例 66. 實施例 64 或 64a 的化合物，其中 J 選自 J-1、J-2、J-3、J-4、J-5、J-7、J-8、J-9、J-10、J-11、J-12、J-14、J-15、J-16、J-20、J-24、J-25、J-26、J-29、J-30、J-37、J-38、J-45 和 J-69。

實施例 67. 實施例 66 的化合物，其中 J 選自 J-4、J-5、J-8、J-11、J-15、J-16、J-20、J-29、J-30、J-37、J-38 和 J-69。

實施例 68. 實施例 67 的化合物，其中 J 選自 J-4、J-5、J-11、J-20、J-29、J-37、J-38 和 J-69。

實施例 69. 實施例 68 的化合物，其中 J 為 J-11。

實施例 70. 實施例 68 的化合物，其中 J 為 J-29。

實施例 71. 實施例 68 的化合物，其中 J 為 J-69。

實施例 72. 實施例 64 至 71 中任一者的化合物，其中 X 為 1、2 或 3。

實施例 72a. 實施例 64 至 71 中任一者的化合物，其中 X 為 1 或 2。

實施例 73. 實施例 72a 的化合物，其中 X 為 1。

實施例 74. 實施例 69 的化合物，其中 J-11 的 3-位置連接至式 1 的 Z，並且 J-11 在 5-位置被選自 R^6 而不是 H 的基團取代。

實施例 75. 實施例 74 的化合物，其中 J-11 的 3-位置連接至式 1 的 Z，並且 J-11 在 5-位置被 $-Z^2Q$ 取代。

實施例 76. 實施例 70 的化合物，其中 J-29 的 3-位置連接至式 1 的 Z，並且 J-29 在 5-位置被選自 R^6 而不是 H 的取代基取代。

實施例 77. 實施例 76 的化合物，其中 J-29 的 3-位置連接至式 1 的 Z，並且 J-29 在 5-位置被 $-Z^2Q$ 取代。

實施例 78. 式 1 或實施例 1 至 77 中任一者的化合物，其中每個 R^6 在單獨出現時（即沒有與 R^{6a} 一起使用時）獨立地為 H、鹵素、氰基、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵炔基、 C_3-C_8 環烷基、 C_3-C_8 鹵環烷基、 C_4-C_{10} 烷基環烷基、 C_4-C_{10} 環烷基烷基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 C_4-C_{10} 環烷氧基烷基、 C_3-C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2-C_6 烷硫基烷基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_3-C_8 環烷氧基、 C_3-C_8 鹵環烷氧基、 C_4-C_{10} 環烷基烷氧基、 C_2-C_6 烯氧基、 C_2-C_6 鹵烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_2-C_6 鹵炔氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷氧基、 C_2-C_6 烷基羰基氧

基、C₂-C₆ 鹵烷基羰基氧基、C₄-C₈ 環烷基羰基氧基、C₃-C₆ 烷基羰基烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 鹵烷硫基、C₃-C₈ 環烷硫基、C₃-C₁₀ 三烷基矽烷基、-NR¹⁷R¹⁸ 或-Z²Q。

實施例 79. 實施例 78 的化合物，其中每個 R⁶ 在單獨出現時獨立地為 H、氟基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₃-C₈ 環烷基、C₃-C₈ 鹵環烷基、C₂-C₆ 烷氧基烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、C₃-C₈ 環烷氧基、C₂-C₆ 烯氧基、C₂-C₆ 鹵烯氧基、C₂-C₆ 炔氧基、C₂-C₆ 烷氧基烷氧基、C₂-C₆ 烷基羰基氧基、C₂-C₆ 鹵烷基羰基氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 鹵烷硫基、C₃-C₁₀ 三烷基矽烷基、-NR¹⁷R¹⁸ 或-Z²Q。

實施例 80. 實施例 78 的化合物，其中每個 R⁶ 在單獨出現時獨立地為 H、鹵素、氟基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、-NR¹⁷R¹⁸ 或-Z²Q。

實施例 80a. 實施例 80 的化合物，其中每個 R⁶ 在單獨出現時獨立地為 H、氟基、C₁-C₆ 烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、-NR¹⁷R¹⁸ 或-Z²Q。

實施例 80b. 實施例 80a 的化合物，其中每個 R⁶ 在單獨出現時獨立地為 H、氟基、C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基、-NR¹⁷R¹⁸ 或-Z²Q。

實施例 81. 實施例 78 的化合物，其中每個 R^6 在單獨出現時獨立地為 H、鹵素、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基或 $-Z^2Q$ 。

實施例 81a. 實施例 81 的化合物，其中每個 R^6 在單獨出現時獨立地為 H、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基或 $-Z^2Q$ 。

實施例 82. 實施例 81 的化合物，其中每個 R^6 在單獨出現時為 $-Z^2Q$ 。

實施例 79a. 式 1 或實施例 1 至 81 中任一者的化合物，其中每個 R^6 為單獨出現。

實施例 83. 式 1 或實施例 1 至 82 中任一者的化合物，其中每個 Z^2 獨立地為直接鍵、O、 $C(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 或 $CH(R^{12})$ 。

實施例 84. 實施例 83 的化合物，其中每個 Z^2 為直接鍵。

實施例 85. 式 1 或實施例 1 至 84 中任一者的化合物，其中每個 R^{18} 獨立地為 C_1-C_3 烷基或 $-Z^3Q$ 。

實施例 86. 實施例 85 的化合物，其中每個 R^{18} 獨立地為 C_1-C_3 烷基。

實施例 87. 式 1 或實施例 1 至 85 中任一者的化合物，其中每個 Z^3 獨立地為 $C(=O)$ 或 $S(=O)_2$ 。

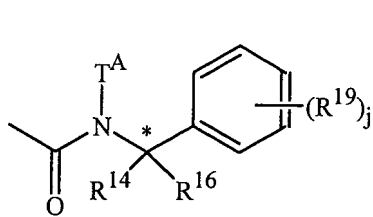
實施例 88. 實施例 87 的化合物，其中每個 Z^3 為 $C(=O)$ 。

實施例 89. 式 1 或實施例 1 至 88 中任一者的化合物，其中僅在一種情況下 R^6 為 $-Z^2Q$ 。

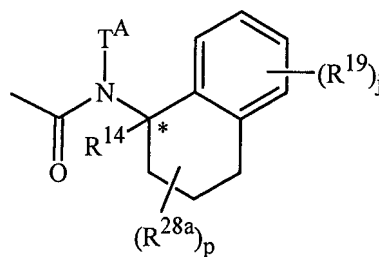
實施例 90. 實施例 63 的化合物，其中當 Z 為直接鍵時，J 為 $C(=W^2)NTAT^B$ 。

實施例 91. 式 1 或實施例 1 至 90 中任一者的化合物，其中當 J 為 $C(W^2)NTAT^B$ 時，J 選自示例 4 中 J-83 至 J-93。

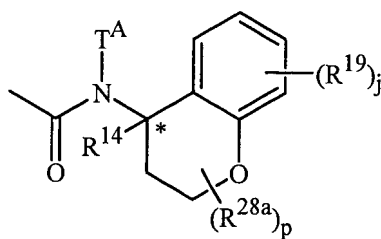
示例 4



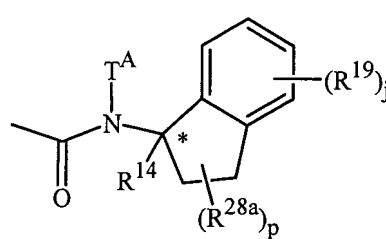
J-83



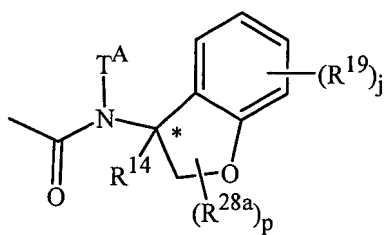
J-84



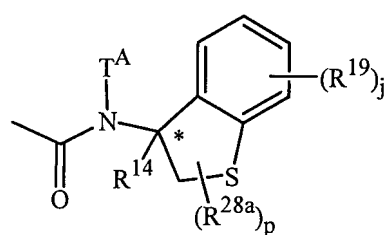
J-85



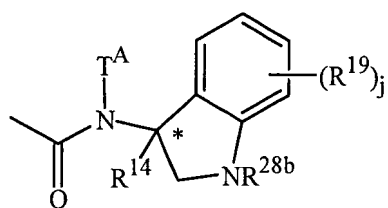
J-86



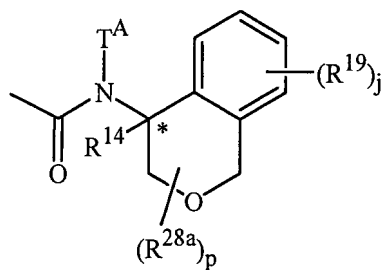
J-87



J-88



J-89



J-90

實施例 96. 式 1 或實施例 1 至 95 中任一者的化合物，其中每個 R^{19} 在單獨出現時（即非與 R^{16} 一起出現）時獨立地為鹵素或 C_1-C_3 烷基。

實施例 97. 式 1 或實施例 1 至 96 中任一者的化合物，其中 R^{16} 在單獨出現時（即非與 R^{19} 一起出現）時為 H 或 C_1-C_3 烷基。

實施例 98. 實施例 97 的化合物，其中 R^{16} 在單獨出現時為 H 或甲基。

實施例 99. 式 1 或實施例 1 至 98 中任一者的化合物，其中當 R^{16} 和 R^{19} 與它們連接的原子一起形成 3-至 7-員環時，所述環含有選自碳原子和最多 2 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 2 個 N，其中最多 2 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，而硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，並且該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、羥基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代。

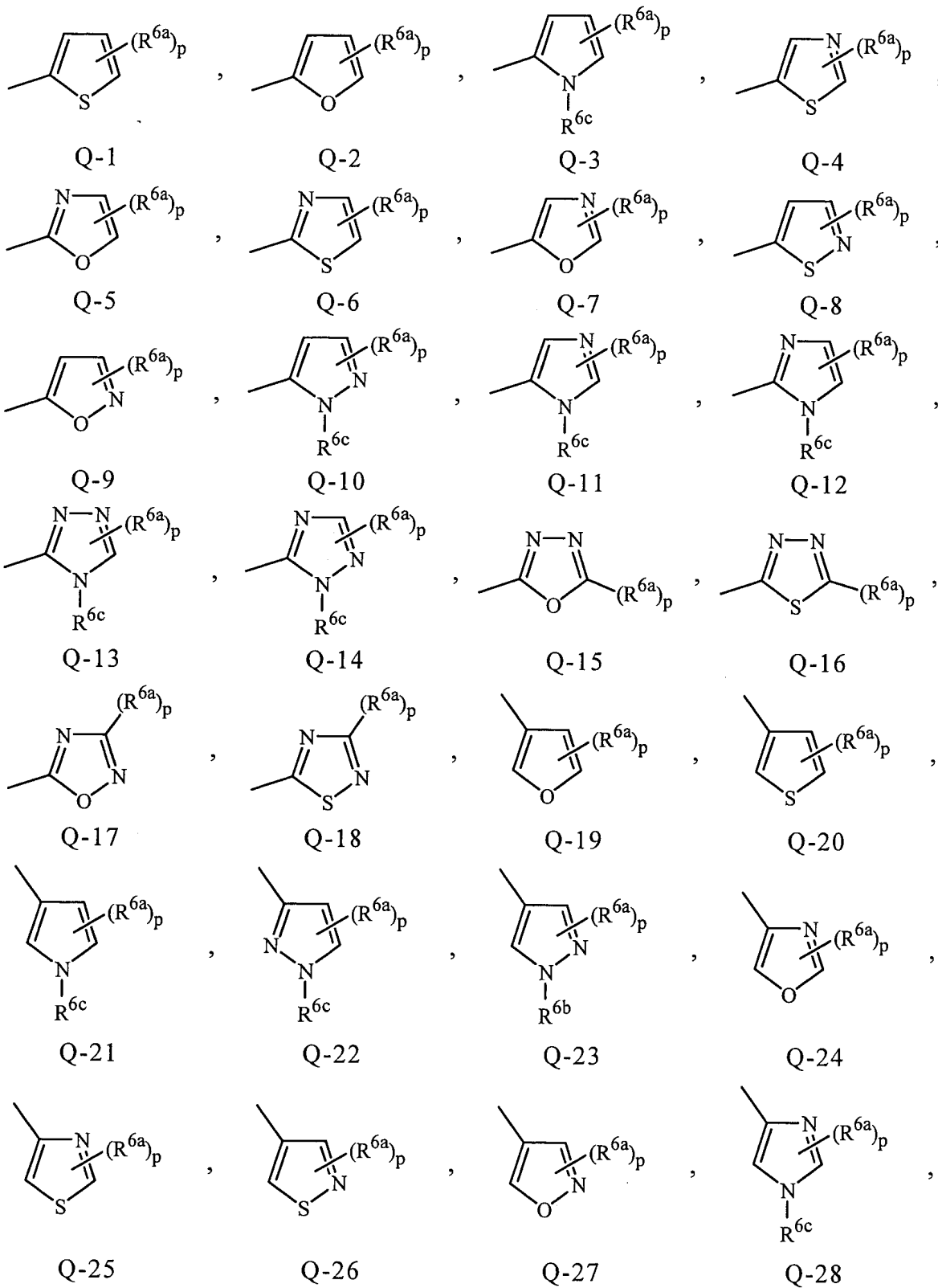
實施例 100. 式 1 或實施例 1 至 99 中任一者的化合物，其中每個 Q 獨立地為苯基、苄基、萘基、5-至 6-員雜芳環或 8-至 11-員雜芳族雙環系統，每個的碳和氮原子環員上任選經最多 1 個選自 R^{6b} 的取代基取代，最多 5 個獨立選自碳原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的 C_1-C_3 烷

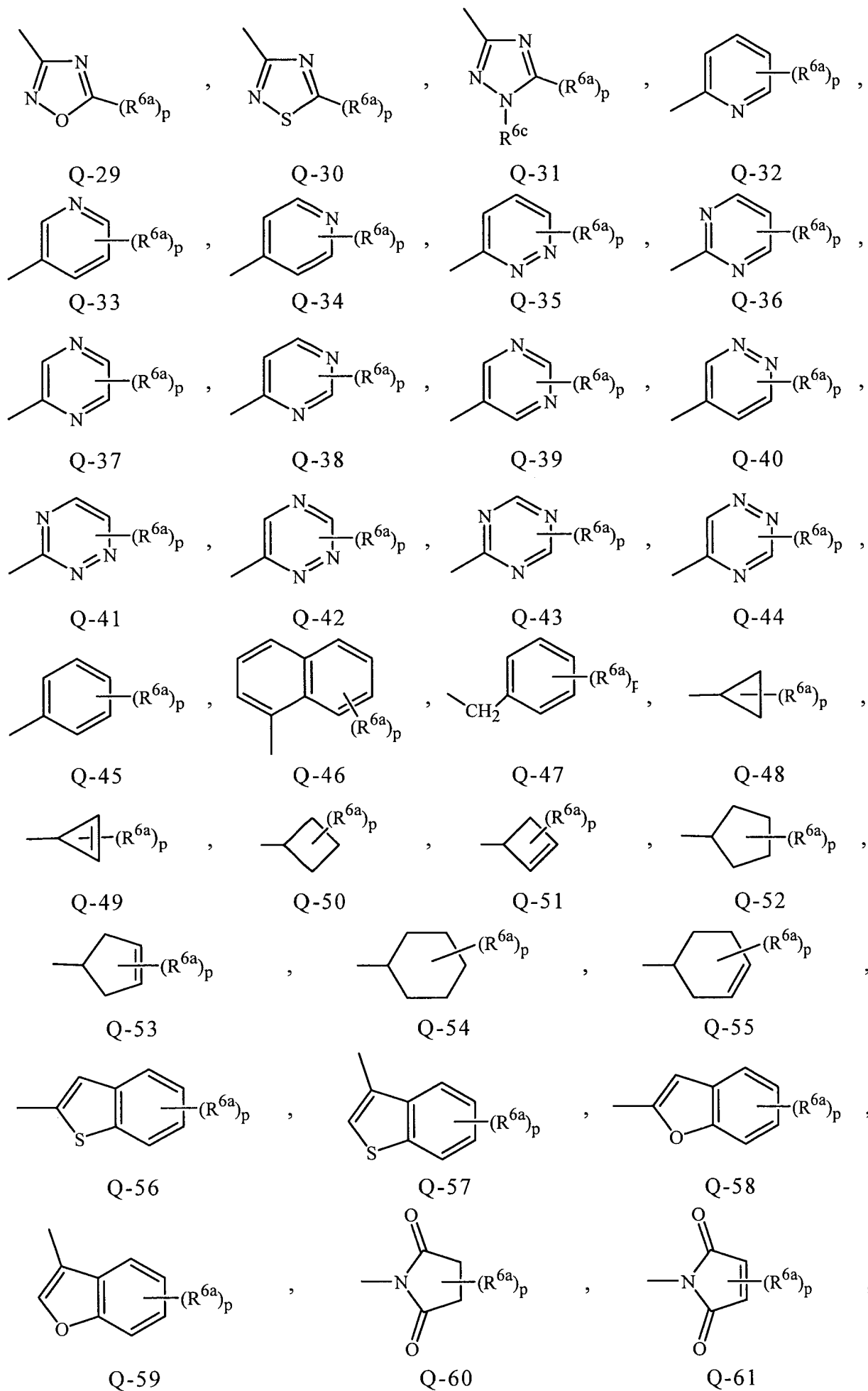
基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 烷氧基羰基或 C_1-C_3 烷氧基的取代基；或

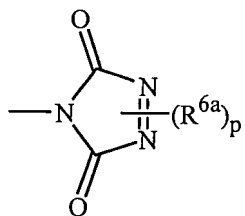
3-至 7-員非芳族碳環、5-至 7-員非芳族雜環或 8-至 11-員非芳族雙環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而矽原子環員獨立選自 SiR^9R^{10} ，每個環或環系統任選經最多 1 個選自碳和氮原子環員上的 R^{6b} 的取代基取代，最多 5 個獨立選自碳原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 烷氧基羰基和 C_1-C_3 烷氧基的取代基。

實施例 101. 實施例 100 的化合物，其中 Q 為選自 Q-1 至 Q-102 的環，如下面示例 5 中所示。

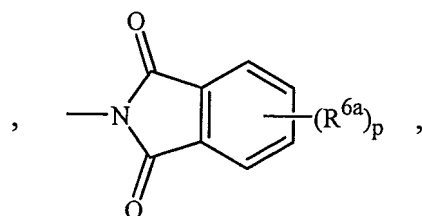
示例 5



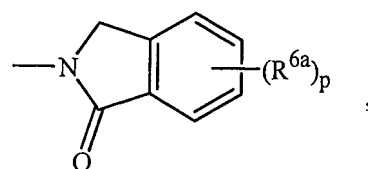




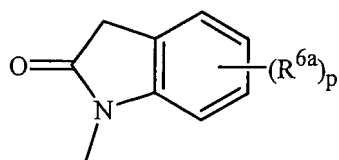
Q-62



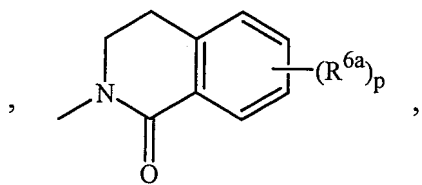
Q-63



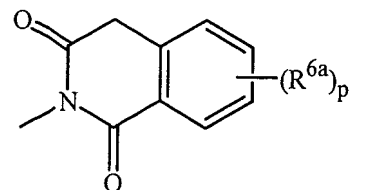
Q-64



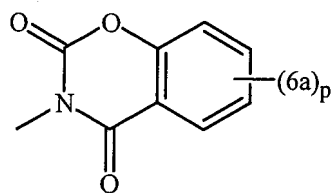
Q-65



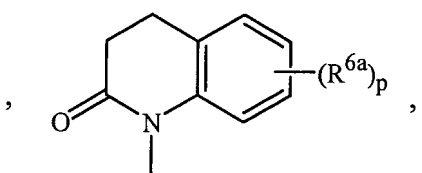
Q-66



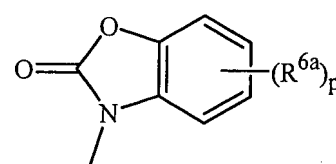
Q-67



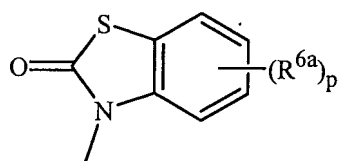
Q-68



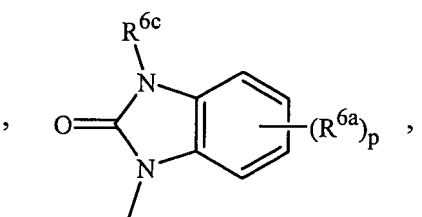
Q-69



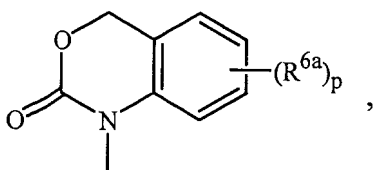
Q-70



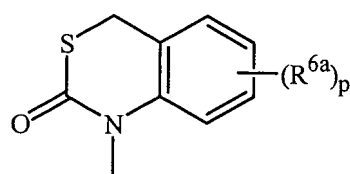
Q-71



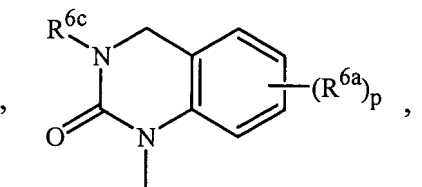
Q-72



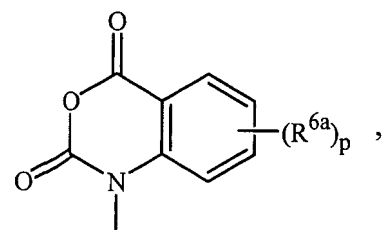
Q-73



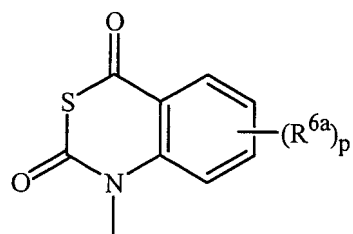
Q-74



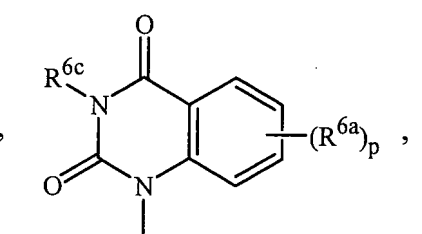
Q-75



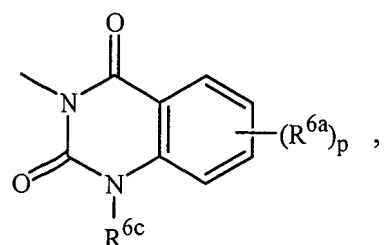
Q-76



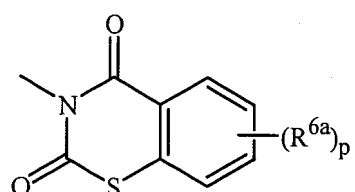
Q-77



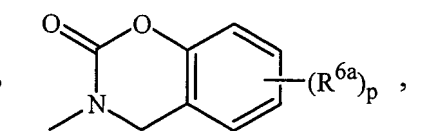
Q-78



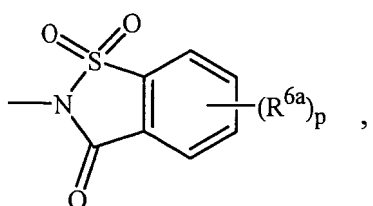
Q-79



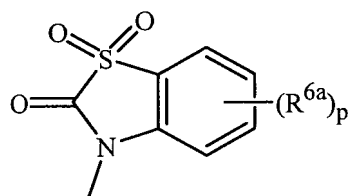
Q-80



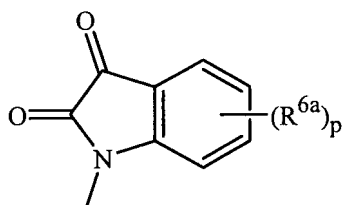
Q-81



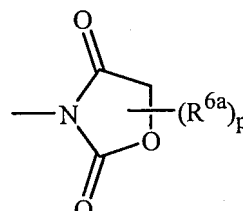
Q-82



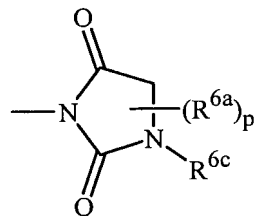
Q-83



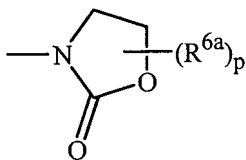
Q-84



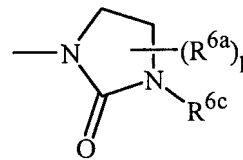
Q-85



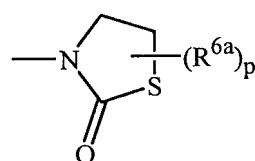
Q-86



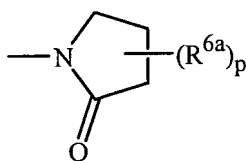
Q-87



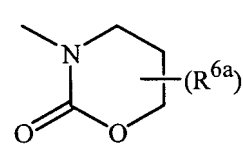
Q-88



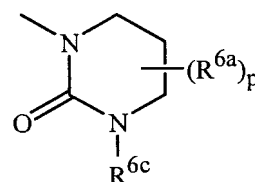
Q-89



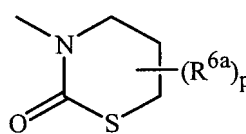
Q-90



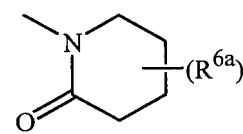
Q-91



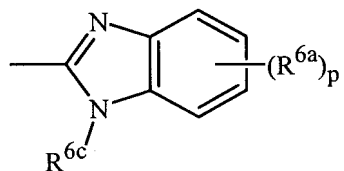
Q-92



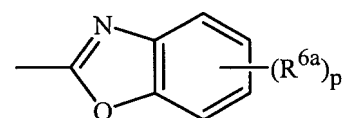
Q-93



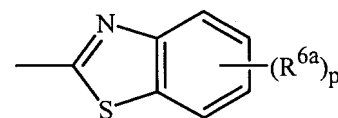
Q-94



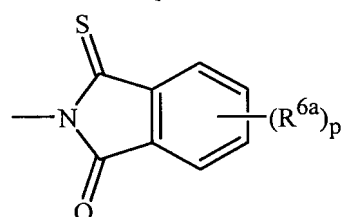
Q-95



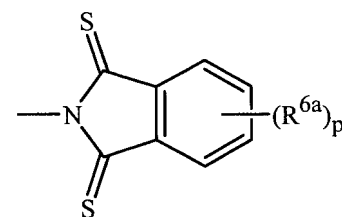
Q-96



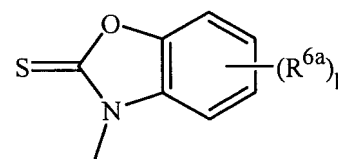
Q-97



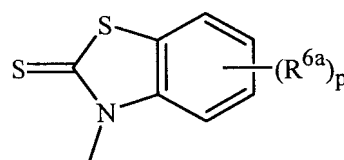
Q-98



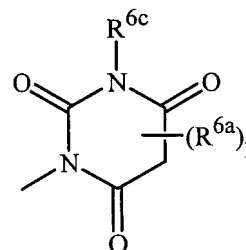
Q-99



Q-100



Q-101



Q-102

其中向左伸出的鍵連接至式 1 的 Z^2 ；並且每個 R^{6c} 獨立選自 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烷基羰基、 C_2 - C_3 烷氧基羰基和 C_1 - C_3 烷氧基；p 為 0 至 5 的整數；而 g 為 0 至 1 的整數。

實施例 102. 實施例 101 的化合物，其中 p 為 0、1、2 或 3。

實施例 102a. 實施例 101 的化合物，其中 p 為 0、1 或 2。

實施例 102b. 實施例 101 的化合物，其中 p 為 1 或 2。

實施例 103. 實施例 101 至 102b 中任一者的化合物，其中 Q 選自 Q-1、Q-20、Q-32 至 Q-34、Q-45 至 Q-47、Q-60 至 Q-73、Q-76 至 Q-79、Q-84 至 Q-94 和 Q-98 至 Q-102。

實施例 104. 實施例 103 的化合物，其中 Q 選自 Q-1、Q-45、Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、Q-69、Q-70、Q-71、Q-72、Q-73、Q-76、Q-78、Q-79、Q-84、Q-85、Q-98、Q-99、Q-100、Q-101 和 Q-102。

實施例 105. 實施例 104 的化合物，其中 Q 選自 Q-45、Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、Q-69、Q-70、Q-71、Q-72、Q-84 和 Q-85。

實施例 106. 實施例 105 的化合物，其中 Q 選自 Q-45、Q-63、Q-65、Q-70、Q-71、Q-72、Q-84 和 Q-85。

實施例 107. 實施例 106 的化合物，其中 Q 選自 Q-45、Q-63、Q-65、Q-70、Q-71、Q-72 和 Q-84。

實施例 107a. 實施例 107 的化合物，其中 Q 選自 Q-45、Q-63、Q-70、Q-71、Q-72 和 Q-84。

實施例 108. 式 1 或實施例 1 至 107 中任一者的化合物，其中每個 R^{6a} 在單獨出現時（即沒有與 R^6 一起使用時）獨立地為鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基或 C_1-C_3 鹵烷氧基。

實施例 108a. 實施例 108 的化合物，其中每個 R^{6a} 在單獨出現時獨立地為鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基或 C_1-C_2 鹵烷氧基。

實施例 108b. 實施例 108a 的化合物，其中每個 R^{6a} 在單獨出現時獨立地為鹵素、羥基、氰基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基或 C_1-C_2 烷氧基。

實施例 108c. 實施例 108b 的化合物，其中每個 R^{6a} 在單獨出現時獨立地為鹵素、羥基、氰基、 C_1-C_2 烷基或 C_1-C_2 烷氧基。

實施例 108d. 實施例 108c 的化合物，其中每個 R^{6a} 在單獨出現時獨立地為 F、Cl、Br、羥基、氰基、甲基或甲氧基。

實施例 108e. 實施例 108c 的化合物，其中每個 R^{6a} 在單獨出現時為 F。

實施例 108f. 實施例 108c 的化合物，其中每個 R^{6a} 在單獨出現時為氰基或甲基。

實施例 109. 式 1 或實施例 1 至 108f 中任一者的化合物，其中每個 R^{6a} 為單獨出現。

實施例 111. 式 1 中任一者或實施例 1 至 109 中任一者的化合物，其中當 R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成環時，所述環為 5-至 6-員環並且含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，並且該環任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基和氮原子環員上的 C_1-C_2 烷基的取代基取代。

實施例 112. 實施例 111 的化合物，其中當 R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成環時，該環含有選自碳原子和最多 1 個雜原子的環員，所述雜原子選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，並且所述環的碳原子環員上任選被最多 1 個獨立選自鹵素、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代。

本發明的實施例（包括上面的實施例 1-112 以及本文描述的任何其他實施例）可以以任何方式組合，並且實施例中的改變的描述不僅涉及包含式 1 化合物的組合物，而且還涉及式 1 化合物、可用於製備式 1 化合物的起始化合物和中間化合物，除非在實施例中有另外說明。另外，本發明的實施例（包括上面的實施例 1-112 以及本文描述的任何其他實施例）及其組合涉及本發明

的組合物和方法。實施例 1-112 的組合可通過如下進行說明：

實施例 A1. 式 1 化合物，其中

A 為 -O-、-S- 或 -N(R⁷)-；

G 為 5 員雜環，任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的 R²⁶ 和氮原子環員上的 R²⁷ 的取代基取代；

每個 R²⁶ 獨立地為鹵素、C₁-C₃ 烷基或 C₁-C₃ 鹵烷基；

每個 R²⁷ 獨立地為 C₁-C₃ 烷基；

Z 為直接鍵、CH(R¹²) 或 N(R¹³)；

J 為 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 與最多 4 個 N，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 C(=O) 和 C(=S)，硫原子環員獨立選自 S(=O)_s(=NR¹¹)_f，每個環或環系統任選經最多 5 個獨立選自 R⁶ 取代基取代；或者當 Z 為直接鍵時，J 也為 C(=W²)NT^AT^B；

X 為 X¹、X²、X³、X⁴、X⁵、X⁶、X⁷ 或 X⁸；

R¹ 為 H、氰基、C₁-C₄ 烷基、C₂-C₄ 烯基、C₂-C₄ 炔基、C₁-C₄ 鹵烷基、C₂-C₄ 鹵烯基、C₂-C₄ 鹵炔基、C₂-C₄ 烷氧基烷基、C₂-C₄ 烷硫

基烷基、C₂-C₄ 烷基羰基、C₂-C₄ 鹵烷基羰基、C₂-C₄ 烷氧基羰基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 鹵烷氧基、C₂-C₄ 烯氧基、C₂-C₄ 鹵烯氧基、C₂-C₄ 炔氧基、C₃-C₄ 鹵炔氧基、C₂-C₄ 烷氧基烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 鹵烷硫基、C₁-C₄ 烷基胺基、C₂-C₄ 二烷基胺基、C₁-C₄ 鹵烷基胺基或 C₂-C₄ 鹵二烷基胺基；

R² 為 H、C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 烷氧基或 C₁-C₃ 鹵烷基；或者

R¹ 和 R² 與它們連接的碳原子一起形成 3-至 6-員環，所述環含有選自碳原子和最多 2 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 2 個 N，其中最多 1 個碳原子環員為 C(=O) 或 C(=S) 且該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₁-C₂ 烷氧基和 C₁-C₂ 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 烷氧基的取代基取代；

R³ 為經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環；或 H、氰基、羥基、C₁-C₃ 烷基、C₂-C₃ 烯基、C₂-C₃ 炔基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₂-C₃ 鹵烯基、C₂-C₃ 鹵炔基、C₂-C₃ 烷基羰基、

C₂-C₃ 鹵烷基羰基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基、C₁-C₃ 烷硫基、C₁-C₃ 鹵烷硫基、C₂-C₃ 烷基羰基氧基或 C₂-C₃ 鹵烷基羰基氧基；

R⁴ 為 H 或 C₁-C₂ 烷基；

每個 R⁵ 獨立地為鹵素、氰基、羥基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基或 C₁-C₂ 烷氧基；

R⁶ 獨立地為 H、鹵素、氰基、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基、C₂-C₆ 炔基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₂-C₆ 鹵烯基、C₂-C₆ 鹵炔基、C₃-C₈ 環烷基、C₃-C₈ 鹵環烷基、C₄-C₁₀ 烷基環烷基、C₄-C₁₀ 環烷基烷基、C₂-C₆ 烷氧基烷基、C₄-C₁₀ 環烷氧基烷基、C₃-C₈ 烷氧基烷氧基烷基、C₂-C₆ 烷硫基烷基、C₂-C₆ 烷氧基羰基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、C₃-C₈ 環烷氧基、C₃-C₈ 鹵環烷氧基、C₄-C₁₀ 環烷基烷氧基、C₂-C₆ 烯氧基、C₂-C₆ 鹵烯氧基、C₂-C₆ 炔氧基、C₂-C₆ 鹵炔氧基、C₂-C₆ 烷氧基烷基、C₂-C₆ 烷基羰基氧基、C₂-C₆ 鹵烷基羰基氧基、C₄-C₈ 環烷基羰基氧基、C₃-C₆ 烷基羰基烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 鹵烷硫基、C₃-C₈ 環烷硫基、C₃-C₁₀ 三烷基矽烷基、-NR¹⁷R¹⁸ 或 -Z²Q；
每個 Z² 獨立地為直接鍵、O、C(=O)、S(=O)₂ 或 CH(R₁₂)；

每個 Q 獨立地為苯基、苜基、萘基、5-至 6-員雜芳環或 8-至 11-員雜芳族雙環系統，各任選經最多 1 個選自碳和氮原子環員上的 R^{6b} 的取代基取代，最多 5 個獨立選自碳原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烷基羰基、 C_2 - C_3 烷氧基羰基或 C_1 - C_3 烷氧基的取代基；或 3-至 7-員非芳族碳環、5-至 7-員非芳族雜環或 8-至 11-員非芳族雙環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而矽原子環員獨立選自 SiR^9R^{10} ，每個環或環系統任選經最多 1 個選自碳和氮原子環員上的 R^{6b} 的取代基取代，最多 5 獨立選自碳原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烷基羰基、 C_2 - C_3 烷氧基羰基和 C_1 - C_3 烷氧基的取代基；

每個 R^{6a} 獨立地為鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_1 - C_3 烷氧基或 C_1 - C_3 鹵烷氧基；或者

R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成 5-至 6-員環，所述環含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，所述環任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基和氮原子環員上的 C_1-C_2 烷基的取代基取代；

R^7 為 H、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 $CH_3C(=O)$ 、 $CF_3C(=O)$ 或 $CH_3OC(=O)$ ；
或者

R^2 和 R^7 與它們連接的相連原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環，除相連原子外，該環還含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，所述環任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

每個 R^{13} 獨立為 H、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烷基羰基或 C_2-C_3 烷氧基羰基；

每個 R^{18} 獨立地為 C_1-C_3 烷基或 $-Z^3Q$ ；並且
每個 Z^3 獨立地為 $C(=O)$ 或 $S(=O)_2$ 。

實施例 A2. 實施例 A1 的化合物，其中

A 為 -O- 或 -N(R⁷)- ；

G 為示例 2 中示出的 G-1 至 G-59 中的一者，

其中向左伸出的鍵連接至 X，而向右伸

出的鍵連接至式 1 中的 Z；

每個 R^{26a} 獨立選自 H 和 R²⁶；

R^{27a} 選自 H 和 R²⁷；

Z 為直接鍵；

J 為示例 3 中示出的 J-1 至 J-82 中的一者，

其中浮動鍵透過任何和所述環或環系

統中的可用碳或氮原子連接至式 1 中的

Z；

X 為 1 至 5 的整數；

當 X 為 2、3、4 或 5 時，則最多一 R⁶ 的例

子為 -Z²Q；或者

J 為 C(=W²) NT^AT^B；

W² 為 O；

X 為 X¹、X² 或 X³；

R¹ 為 H、氰基、C₁-C₃ 烷基、C₂-C₃ 烯基、C₂-C₃

炔基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₂-C₃ 鹵烯基、C₂-C₃

鹵炔基、C₁-C₃ 烷氧基或 C₁-C₃ 鹵烷氧

基；

R² 為 H、C₁-C₃ 烷基或 C₁-C₃ 鹵烷基；

R³ 為苯基、萘基或 5-或 6-員雜芳環，每個環

或環系統任選經最多 3 個獨立選自碳原

子環員上的 R^{25a} 和氮原子環員上的 R^{25b}

的取代基取代；或 H、氰基、羥基、C₁-C₃

烷基、C₂-C₃ 烯基、C₂-C₃ 炔基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₂-C₃ 鹵烯基、C₂-C₃ 鹵炔基、C₂-C₃ 烷基羰基、C₂-C₃ 鹵烷基羰基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 鹵烷氧基、C₁-C₃ 烷硫基、C₁-C₃ 鹵烷硫基、C₂-C₃ 烷基羰基氧基或 C₂-C₃ 鹵烷基羰基氧基；

每個 R^{25a} 獨立地為鹵素、氰基、羥基、胺基、硝基、C₁-C₆ 烷基、C₂-C₆ 烯基、C₂-C₆ 炔基、C₃-C₆ 環烷基、C₄-C₁₀ 環烷基烷基、C₄-C₁₀ 烷基環烷基、C₅-C₁₀ 烷基環烷基烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₂-C₆ 鹵烯基、C₂-C₆ 鹵炔基、C₃-C₆ 鹵環烷基、C₁-C₄ 烷氧基、C₁-C₄ 鹵烷氧基、C₁-C₄ 烷硫基、C₁-C₄ 烷基亞磺醯基、C₁-C₄ 烷基磺醯基、C₁-C₄ 鹵烷硫基、C₁-C₄ 鹵烷基亞磺醯基、C₁-C₄ 鹵烷基磺醯基、C₁-C₄ 烷基胺基、C₂-C₈ 二烷基胺基、C₃-C₆ 環烷基胺基、C₂-C₄ 烷氧基烷基、C₁-C₄ 羥烷基、C₂-C₄ 烷基羰基、C₂-C₆ 烷氧基羰基、C₂-C₆ 烷基羰基氧基、C₂-C₆ 烷基羰基硫基、C₂-C₆ 烷基胺基羰基、C₃-C₈ 二烷基胺基羰基或 C₃-C₆ 三烷基矽烷基；

每個 R^{25b} 獨立地為 C₁-C₆ 烷基、C₃-C₆ 烯基、C₃-C₆ 炔基、C₃-C₆ 環烷基、C₁-C₆ 鹵烷基、C₃-C₆ 鹵烯基、C₃-C₆ 鹵炔基、C₃-C₆ 鹵環烷基或 C₂-C₄ 烷氧基烷基；

每個 R^5 獨立地為氰基、甲基或甲氧基；

每個 R^6 獨立地為 H、氰基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_3 - C_8 環烷基、 C_3 - C_8 鹵環烷基、 C_2 - C_6 烷氧基烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基、 C_3 - C_8 環烷氧基、 C_2 - C_6 烯氧基、 C_2 - C_6 鹵烯氧基、 C_2 - C_6 炔氧基、 C_2 - C_6 烷氧基烷氧基、 C_2 - C_6 烷基羰基氧基、 C_2 - C_6 鹵烷基羰基氧基、 C_1 - C_6 烷硫基、 C_1 - C_6 鹵烷硫基、 C_3 - C_{10} 三烷基矽烷基、 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；

每個 Z^2 為直接鍵；

Q 為示例 5 中示出的 Q-1 至 Q-102 中的一者，其中向左伸出的鍵連接至式 1 中的 Z^2 ；

每個 R^{6c} 獨立選自 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烷基羰基、 C_2 - C_3 烷氧基羰基和 C_1 - C_3 烷氧基；

p 為 0 至 5 的整數；

g 為 0 至 1 的整數；

每個 R^{6a} 獨立地為鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基；或

R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成經任選取代的 5-至 6-員環，所述環含有選自碳原子和最多 1 個雜原子的環員，所述雜原子選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最

多 1 個 N 原子，所述環的碳原子環員任選經最多 1 個獨立選自鹵素、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 烷氧基的取代基取代；

R⁷ 為 H 或 C₁-C₂ 烷基；或

R² 和 R⁷ 與它們連接的相連原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環，除了相連原子外，所述環還含有選自碳的環員，所述環任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的 C₁-C₂ 烷基。

每個 R¹⁸ 獨立地為 C₁-C₃ 烷基；並且 n 為 0 或 1。

實施例 A3. 實施例 A2 的化合物，其中

W 為 O；

G 選自 G-1、G-2、G-7、G-8、G-14、G-15、G-23、G-24、G-26、G-27、G-36、G-37、G-38、G-49、G-50 和 G-55；

x 為 1、2 或 3；

J 選自 J-1、J-2、J-3、J-4、J-5、J-7、J-8、J-9、J-10、J-11、J-12、J-14、J-15、J-16、J-20、J-24、J-25、J-26、J-29、J-30、J-37、J-38、J-45 和 J-69；或

J 為示例 4 中示出的 J-83 至 J-91 中的一者，其中向左伸出的鍵連接至 X，而向右伸出的鍵連接至式 1 中的 G，用星號(*)標識的碳原子具有立構中心；

每個 R^6 獨立地為 H、氰基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基、 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；

每個 R^{28a} 獨立選自鹵素、羥基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基並且連接至碳環員；

R^{28b} 選自鹵素、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基；

每個 j 和 p 獨立地為 0、1 或 2；

X 為 X^1 或 X^2 ；

R^1 為 H、 C_1 - C_3 烷基或 C_1 - C_3 氟烷基；

R^2 為 H、 C_1 - C_2 烷基或 C_1 - C_3 氟烷基；

R^3 為示例 1 中示出的 U-1 至 U-11 中的一者其中向左伸出的鍵連接至式 1；

k 為 0、1 或 2；或者

R^3 為 H、氰基、羥基、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 鹵烷氧基、 C_1 - C_3 烷硫基、 C_1 - C_3 鹵烷硫基、 C_2 - C_3 烷基羰基氧基或 C_2 - C_3 鹵烷基羰基氧基；

Q 選自 Q-1、Q-20、Q-32 至 Q-34、Q-45 至 Q-47、Q-60 至 Q-73、Q-76 至 Q-79、Q-84 至 Q-94 和 Q-98 至 Q-102；

每個 R^{6a} 獨立地為鹵素、羥基、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基或 C_1 - C_2 烷氧基；以及

R^7 為 H 或甲基。

實施例 A4. 實施例 A3 的化合物，其中

A 為 -O-

G 選自 G-1、G-2、G-15、G-26、G-27、G-36、
G-37 和 G-38；

J 選自 J-4、J-5、J-8、J-11、J-15、J-16、J-20、
J-29、J-30、J-37、J-38 和 J-69；

X 為 X^1 ；

R^1 為 H、甲基、三氟甲基或 CF_3CH_2 ；

R^2 為 H、甲基或三氟甲基；

R^3 為 H、氰基、甲基、甲氧基或 $CH_3C(=O)O-$ ；

R^4 為 H；

每個 R^6 獨立地為 H、氰基、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；

Q 選自 Q-1、Q-45、Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、
Q-69、Q-70、Q-71、Q-72、Q-73、Q-76、
Q-78、Q-79、Q-84、Q-85、Q-98、Q-99、
Q-100、Q-101 和 Q-102；

每個 R^{6a} 獨立地為鹵素、羥基、氰基、 C_1-C_2
烷基或 C_1-C_2 烷氧基；並且

n 為 0。

實施例 A5. 實施例 A4 的化合物，其中

G 選自 G-1、G-2、G-15、G-26 和 G-36；

x 為 1 或 2；

J 選自 J-4、J-5、J-11、J-20、J-29、J-37、J-38
和 J-69；

R^1 為甲基、三氟甲基或 CF_3CH_2 ；

R^3 為 H；

每個 R^6 獨立地為 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵
烷基或 $-Z^2Q$ ；

Q 選自 Q-45、Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、
Q-69、Q-70、Q-71、Q-72、Q-84 和 Q-85；

並且

每個 R^{6a} 獨立地為 F、Cl、Br、羥基、氰基、
甲基或甲氧基。

實施例 A6. 實施例 A5 的化合物，其中

G 為 G-1；

x 為 1；

J 為 J-29；

R^6 為 $-Z^2Q$ ；並且

Q 選自 Q-45、Q-63、Q-70、Q-71、Q-72 和
Q-84。

實施例 A7. 實施例 A6 的化合物，其中

Q 為 Q-45；

p 為 1 或 2；並且

每個 R^{6a} 為 F。

實施例 A8. 實施例 A6 的化合物，其中

Q 為 Q-45；

p 為 1；並且

每個 R^{6a} 為氰基或甲基。

具體的實施例包括選自以下化合物的式 1 化合物：

2,2,2-三氟乙醛 2-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]-2-甲基脞；

2-[4,5-二氫-3-[2-[1-[2-[(2,2,2-三氟亞乙基)胺基]氧基]乙醯基]-4-哌啶基]-4-噻唑基]-5-異噁唑基]苜腓；

2,2,2-三氟乙醛 *O*-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]脞；

1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[4,5-二氫-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑基-1-基]乙酮；

1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[4,5-二氫-5-甲基-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-1-基]乙酮；

1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[4,5-二氫-5,5-二甲基-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-1-基]乙酮；

2,2,2-三氟乙醛，*O*-[2-[4-[4-(2,3-二氫螺[1*H*-茛-1,5'(4'*H*)-異噁唑]-3'-基)-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]脞；

2,2,2-三氟乙醛，*O*-[2-[4-[4-[4,5-二氫-5-(2-側氧(2*H*)-苯并噁唑基)-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]脞；和

1,1,1-三氟-2-丙酮，*O*-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]脞；

2-丙酮, *O*-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基] 肟;

2-[4,5-二氫-3-[2-[1-[2-[[2,2,2,-三氟-1-甲基亞乙基)胺基]氧基]乙醯基]-4-哌啶基]-4-噻唑基]-5-異噁唑基] 苄腈;

1,1,1-三氟-2-丙酮, *O*-[2-[4-[4-[4,5-二氫-5-(2-側氧-3-(2*H*)-苯并噁唑基)-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基] 肟; 以及

2-丙酮, *O*-[2-[4-[4-[5-(1,3-二氫-1,3-二側氧-2*H*-異吡啶-2-基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基] 肟。

值得注意的式 1 化合物包括它們的幾何異構體和立體異構體、互變異構體、*N*-氧化物及其鹽 (包括但不限於上述的實施例 1-112 與 A1-A6) 其中 R² 為 H、鹵素、氰基、羥基、C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 鹵烷基、C₁-C₃ 烷氧基或 C₁-C₃ 鹵烷氧基。

值得注意的式 1 化合物亦包括它們的幾何異構體和立體異構體、互變異構體、*N*-氧化物及其鹽 (包括但不限於上述的實施例 1-112 與 A1-A6) 其中每個連接至相同碳原子的 R³ 與 R⁴ 為單獨出現 (即非一起形成一飽和碳環)。

值得注意的式 1 化合物進一步包括它們的幾何異構體和立體異構體、互變異構體、*N*-氧化物及其鹽 (包括但不限於上述的實施例 1-112 與 A1-A6) 其中 R¹⁵ 為苯基、苄基、萘基或 5-至 6-員雜芳環, 各任選經最多 3 個獨立選自 R¹⁹ 的取代基取代。

值得注意的式 1 化合物尤其包括它們的幾何異構體和立體異構體、互變異構體、*N*-氧化物及其鹽（包括但不限於上述的實施例 1-112 與 A1-A6）其中 R^2 和 R^7 與它們連接的連接原子一起形成 5-至 7-員環，除了連接原子外，該環還含有選自如下的環員：碳原子和最多 3 個獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子的雜原子，該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基和 C_1 - C_2 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基的取代基取代。

本發明提供了包含選自式 1（包括所有幾何異構體和立體異構體）、它們的互變異構體、*N*-氧化物及其鹽的化合物和至少一種其他殺真菌劑的殺真菌組合物。值得注意的是，這類組合物的實施例是包含對應上述任一化合物實施例的化合物的組合物。

本發明提供了殺真菌組合物，所述組合物包含殺真菌有效量的選自式 1（包括所有幾何異構體和立體異構體、它們的互變異構體、*N*-氧化物及其鹽的化合物）（在一殺真菌有效量上），以及至少一種選自表面活性劑、固體稀釋劑和液體稀釋劑的另外的組分。值得注意的是，這類組合物的實施例是包含對應上述任一化合物實施例的化合物的組合物。

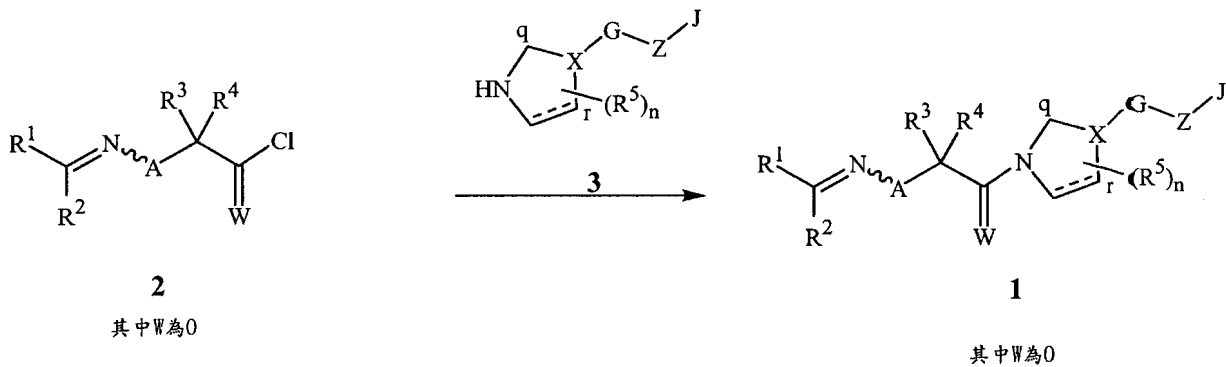
本發明提供了用於控制由真菌植物病原體引起的植物病害的方法，所述方法包括向植物或其部分或者向植物種子施用殺真菌有效量的化合物，所述化合物選自式 1（包括所有幾何異構體和立體異構體、它們的互變

異構體、*N*-氧化物及其鹽)。值得注意的是，這種方法的實施例是包括施用殺真菌有效量的對應上述任何化合物實施例的化合物的方法。特別值得注意的是其中化合物作為本發明組合物施用的實施例。

一種或多種下面方案 1-20 中描述的方法和變型形式可用於製備式 1 化合物。下面的式 1-40 化合物中的 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、A、G、J、W、TA, TB、W、 W^2 、X、Z、和 n 的定義與上文「發明內容」中的定義相同，除非另外指明。式 1a 和式 1b 的化合物是式 1 的子集，並且式 1a 和式 1b 的所有取代基是如上文對式 1 的定義，除非另有註明。

如在方案 1 中所示，其中 W 為 O 的式 1 化合物可以通過將式 2 的醯基氯與式 3 的胺（或其酸性鹽）在存在酸清除劑的情況下偶聯而製備。典型的酸清除劑包括胺鹼例如三乙胺、*N,N*-二異丙基乙胺和吡啶。其他酸清除劑包括氫氧化物例如氫氧化鈉和氫氧化鉀，以及碳酸鹽例如碳酸鈉和碳酸鉀。在某些情況下，有益的是使用聚合物-負載的酸清除劑，例如聚合物-鍵合的 *N,N*-二異丙基乙胺和聚合物-鍵合的 *N,N*-二甲基-4-吡啶胺。式 3 的胺的酸性鹽也可用於該方法，前提條件是存在至少 2 當量的酸清除劑。通常用於與胺形成鹽的酸包括鹽酸、草酸和三氟乙酸。

方案 1



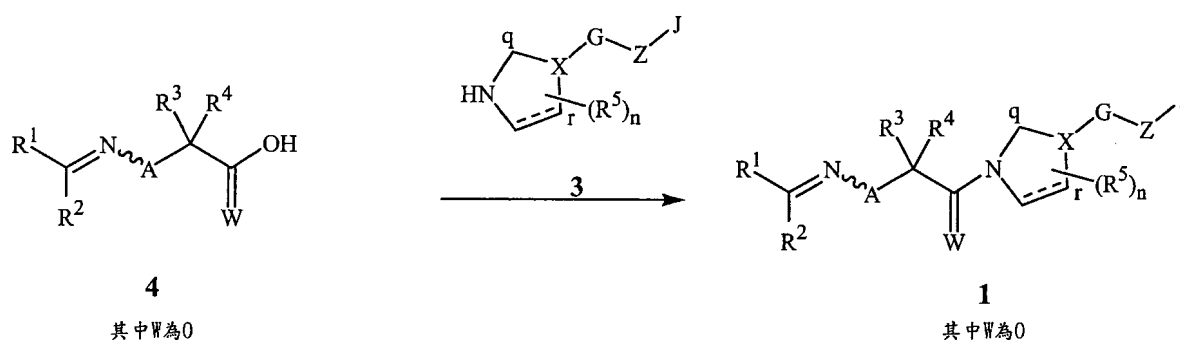
在後續步驟中，採用多種標準硫雜化試劑如五硫化二磷或 2,4-雙(4-甲氧苯基)-1,3-二硫雜-2,4-二磷雜環丁烷-2,4-二硫化物(拉韋松試劑(Lawesson's reagent))，可將其中 W 為 O 的式 1 化合物轉化成其中 W 為 S 的相應硫醯胺。

如方案 2 中所示，在可供選擇的方法中，其中 W 為 O 的式 1 化合物可通過使式 4 的酸與式 3 的胺(或其酸性鹽)在存在去水偶聯劑如二環-己基碳二亞胺(DCC)、1-(3-二甲基胺丙基)-3-乙基碳二醯亞胺鹽酸鹽(EDC)或 O-苯并三唑-1-基-N,N,N',N'-四甲基尿六氫磷酸鹽(HBTU)的情況下偶聯而製備。聚合物-負載的試劑是可用的，例如聚合物-鍵合的環己基碳二醯亞胺。這些反應通常在 0-40°C 下於溶劑如二氯甲烷或乙腈中，並且在存在鹼如三乙胺或 N,N-二異丙基乙胺的情況下進行。

式 4 的起始酸是已知的或者可通過本領域技術人員已知的方法製備。對於主要的參考文獻，參見例如 Schumann 等人，*Journal of Medicinal & Pharmaceutical*

Chemistry 1962, 5, 464-77; Van Dijk 等人, *Journal of Medicinal Chemistry* 1977, 20(9), 1199-206; A. Balsamo 等人, *Journal of Medicinal Chemistry* 1989, 32, 1398-1401, 和美國專利第 4,584,014 號。式 4 的酸對於製備用於方案 1 方法的式 2 酸氯化物為有用的中間體。可使用於轉換酸成為酸氯化物的各式熟知條件係公開於化學文獻中。

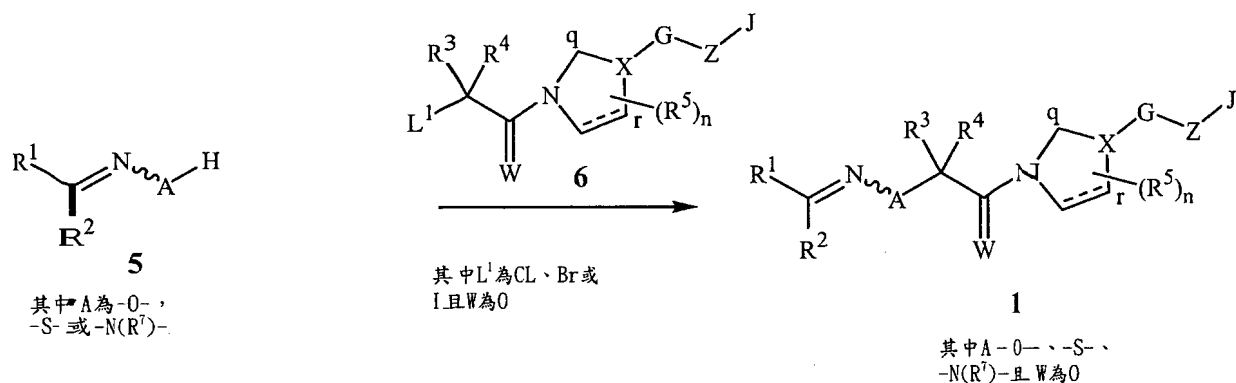
方案 2



由於綜合性文獻包括許多種形成醯胺鍵的方法，所以方案 1 和 2 中的方法只是可用於製備式 1 化合物的各種各樣的方法中的簡單代表性實例。

在一替代性方法中，其中 A 為 -O-、-S- 和 -N(R⁷)- 且 W 為 O 的式 1 化合物可通過如方案 3 中所示使式 5 化合物與式 6 的鹵乙醯胺反應製備。該反應在存在鹼如氫化鈉或碳酸鉀以及溶劑如四氫呋喃、N,N-二甲基甲醯胺或乙腈的情況下通常在 0 至 80 °C 的溫度間進行。

方案 3

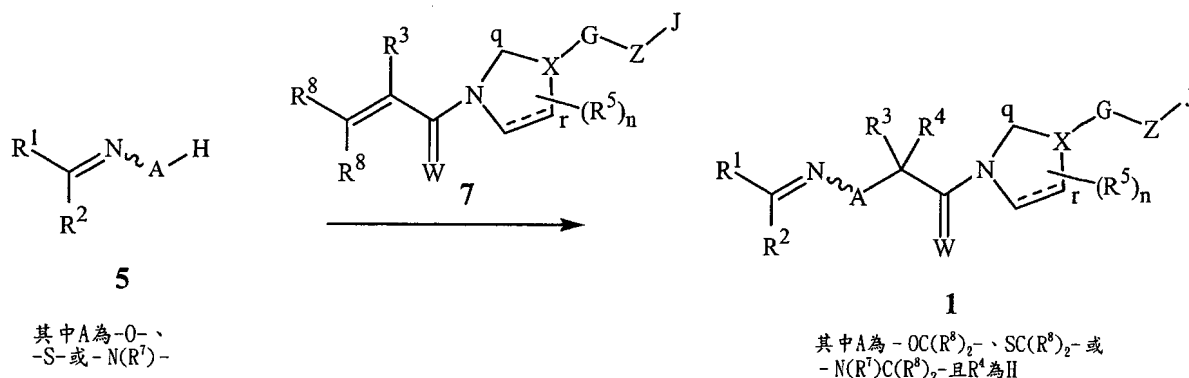


式 5 的亞胺、肟和脞是已知的並且可通過本領域已知的方法製備；參見例如 S. Dayagi 等人，*The Chemistry of the Carbon-Nitrogen Double Bond*, S. Patei (編輯)，Interscience, New York 1970；S.R. Sandler 等人，*Organic Functional Group Preparations*, Academic Press, New York 1972, 3, 372 和 G. Hilgetag 等人，*Preparative Organic Chemistry*, John Wiley & Sons, New York 1972, 504-515。式 6 的鹵乙醯胺可通過讓式 3 的胺與 α -鹵羧酸鹵化物或 α -鹵羧酸（或其酸酐）反應而製備，使用的條件與描述用於方案 1 或 2 中的醯胺形成反應者類似。

式 1 化合物（其中 A 為 $-OC(R^8)_2-$ 、 $-SC(R^8)_2-$ 或 $-N(R^7)C(R^8)_2-$ ，並且 R^4 為 H）可如方案 4 所示，通過式 5 化合物與式 7 的 $\alpha\beta$ -不飽和醯胺的鹼催化縮合反應製備，其中式 5 中的 A 和式 7 中的 $C(R^8)_2$ 形成式 1 中的 A 。該反應通常是在 0 至 80 °C 間的溫度，在存在鹼如氫氧化鈉或氫氧化鉀、氫化鈉或碳酸鉀的情況下，在溶劑諸如四氫呋喃、 N,N -二甲基甲醯胺、乙醇或乙腈中進行。式 7 的 $\alpha\beta$ -不飽和醯胺可使用與所述用於方案 1 和 2 者

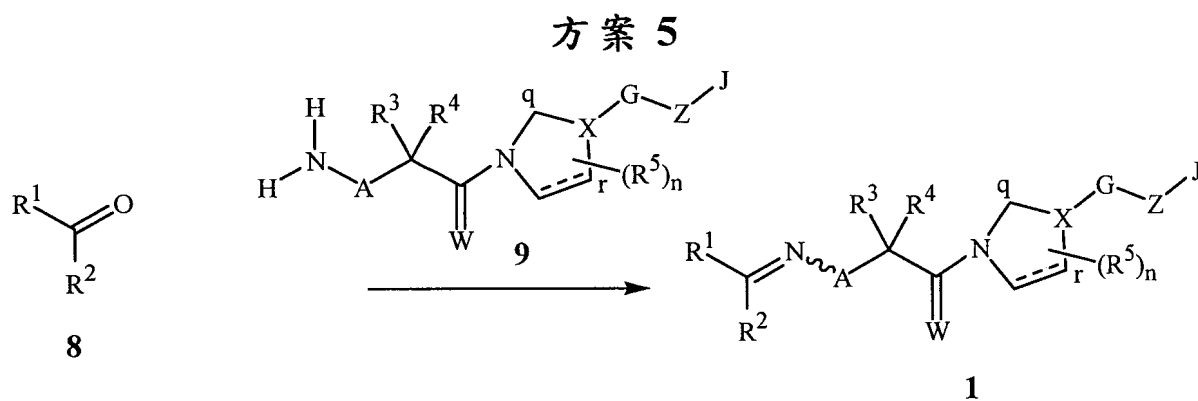
類似的條件，使相應的 α,β -不飽和酸或酸氯化物與式 3 的胺偶聯而製備。

方案 4



式 1 化合物還可如方案 5 所示，通過使式 8 化合物與式 9 化合物反應而製備。該反應是在諸如乙醇、四氫呋喃或水之類的溶劑中，任選在存在諸如乙酸、鹽酸或硫酸之類的酸催化劑的情況下進行。式 9 的酸性鹽也可用於方案 5 的方法中，較佳在存在至少一莫耳當量的酸清除劑（例如吡啶或三乙胺）的情況下使用。酸性鹽可藉由用鹽酸、草酸或三氟乙酸處理式 9 的胺而製備。胺與羰基化合物的反應是為人所熟知的；參見（例如）Dayagi 等人，*The Chemistry of the Carbon-Nitrogen Double Bond*, Patei（編輯），Interscience, New York 1970；Sandler 等人，*Organic Functional Group Preparations*, Academic Press, New York 1972, 3, 372 和 Hilgetag 等人，*Preparative Organic Chemistry*, John Wiley & Sons, New York 1972, 504-515。式 8 化合物是已知的，或者可通過本領域技術人員已知的方法製備。

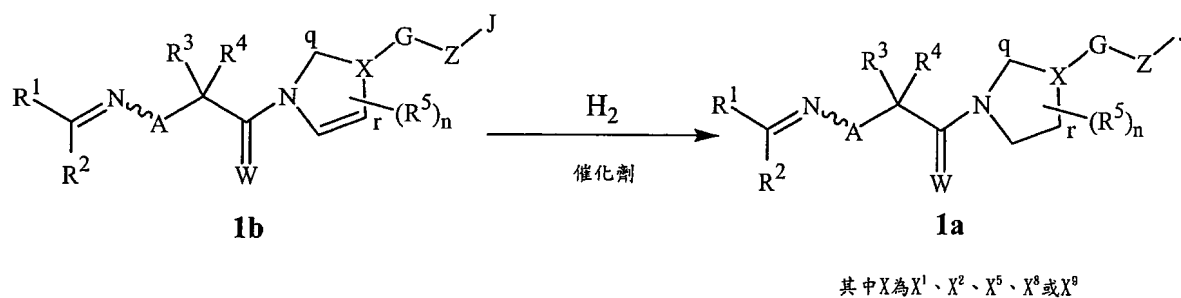
式 9 化合物可直接製備或通過使相應的式 9 的 *N*-保護化合物去保護而製備。式 9 的 *N*-保護化合物可通過與已針對方案 1、2、3 和 4 所描述的那些類似的方法製備。合適的 *N*-保護的氮基團的選擇對本領域技術人員來說將是顯而易見的；用這些保護基團來保護氮原子的方法描述於對於代表性的例子，請參見 Greene, T. W. 和 Wuts, P. G. M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 第 2 版；Wiley: New York, 1991。



式 1a 化合物（其中含有 X 的環為飽和的式 1 化合物）其中 X 為 X^1 、 X^2 、 X^5 、 X^8 和 X^9 可如方案 6 中所示，通過催化氫化來從相應的式 1b 不飽和化合物製備。使式 1b 化合物與氫氣接觸的典型條件包括：氣壓由約 70 至 700 kPa，較佳 270 至 350 kPa；存在金屬催化劑，例如，諸如活性碳之類的惰性載體上負載的鈀（金屬與載體的重量比為 5 至 20%）；懸浮在諸如乙醇之類的溶劑中；在環境溫度（如約 15-20 °C）下。這種類型的還原為人所熟知的；參見（例如）*Catalytic Hydrogenation*, L. Cervený（編輯），Elsevier Science, Amsterdam, 1986。

本領域技術人員將認識到，在催化氫化條件下，可存在於式 1a 化合物中的某些其他官能團也可能會被還原，因此需要對催化劑和條件進行適當選擇。

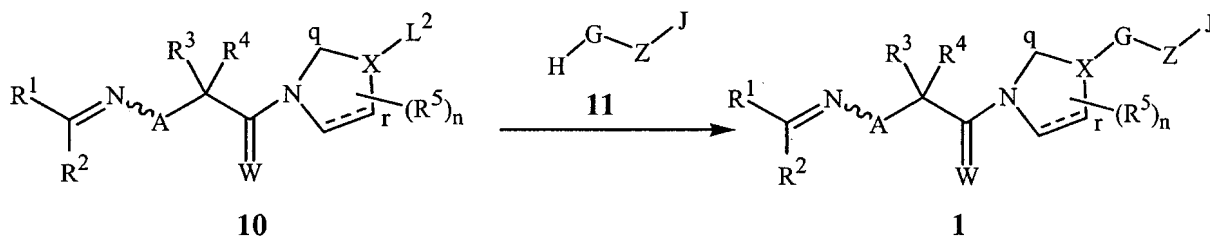
方案 6



如方案 7 所述，式 1 化合物（其中 X 為 X¹、X⁵、X⁷ 或 X⁹ 並且 G 通過氮原子連接至含有 X 的環）可如方案 7 所示，在存在鹼的情況下，通過用式 11 的含氮雜環置換式 10 化合物中的合適脫離基 L²（例如 Br、I、或磺酸根如 CH₃S(O)₂O 或 CF₃S(O)₂O）而製備。該反應典型是在約 0 至 80 °C 下，在諸如 N,N-二甲基甲醯胺或乙腈之類的溶劑中並在鹼如氫化鈉或碳酸鉀存在下進行。

式 10 化合物可用本領域已知的通用方法，從其中 L² 為 OH 的式 10 相應化合物製備。

方案 7



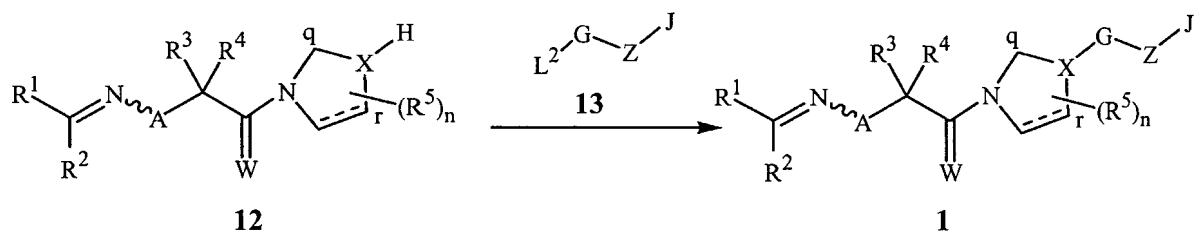
其中L²為脫離基(e. g. Br、I、MeS(O)₂O或CF₃S(O)₂O)

其中X為X¹、X²、X³、X⁷或X⁹

式 1 化合物(其中 X 為 X² 或 X⁸)可如方案 8 所示, 通過讓式 12 化合物與式 13 的雜環化合物(其中 L² 為脫離基(例如 Br、I、或磺酸根如 CH₃S(O)₂O 或 CF₃S(O)₂O)反應而製備。該反應是在約 0 至 80 °C 的溫度下, 在諸如二甲基亞砷、N,N-二甲基甲醯胺或乙腈之類的溶劑中, 及在存在諸如碳酸鉀之類的鹼的情況下進行。

式 13 化合物可通過本領域技術人員已知的方法, 從其中 L² 為 OH 的式 13 對應化合物製備。

方案 8



其中L²為脫離基(e. g. Br、I、MeS(O)₂O或CF₃S(O)₂O)

其中X為X²或X⁸

式 3 的胺可如方案 9 所示, 通過去保護反應從其中 Y¹ 為胺保護基團的式 14 化合物製備(用於胺去保護的方法參見, 例如 Greene, T. W.和 Wuts, P. G. M. *Protective*

Groups in Organic Synthesis, 第 2 版 ; Wiley: New York, 1991)。眾多各式胺保護基團適用於方案 9 的方法，並期合適保護基團的選擇對化學合成領域中的技術人員來說將是顯而易見的。去保護後，可通過本領域已知的通用方法，將式 3 的胺以酸性鹽或游離胺的形式分離。

方案 9



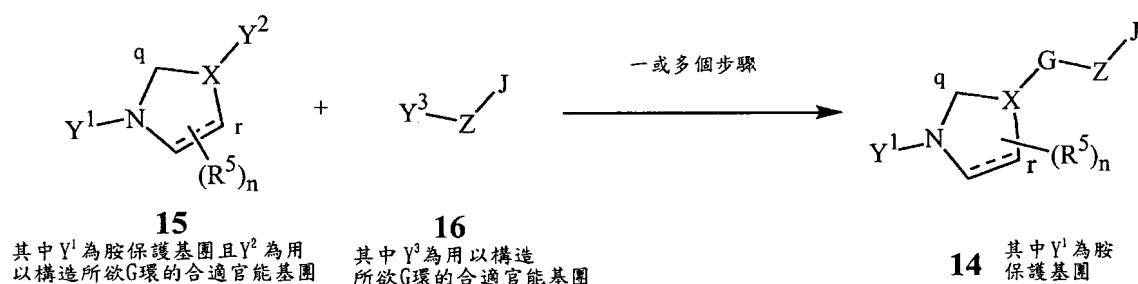
其中 Y¹ 為胺保護基團

式 14 的胺可通過類似於上文方案 6、7 或 8 中所描述者的那些方法製備，其中式 1b、式 10 和式 12 中的 (R¹)(R²)=N=~AC(R³)(R⁴)C(=W)-部分由 Y¹ 置換。

式 14 的胺也可以如方案 10 所示，通過使經適當官能化的式 15 化合物與經適當官能化的式 16 化合物反應而製備。官能團 Y² 和 Y³ 選自（但不限於）諸如醛、酮、酯、酸、醯胺、硫醯胺、腓、胺、醇、硫醇、肼、肟、脒、醯胺肟、烯、炔、鹵化物、烷基鹵、甲磺酸酯、三氟甲磺酸酯、硼酸、硼酸酯等之類的部分，這些部分在合適的反應條件下，將使得能用以構造多種雜環 G 環。例如，其中 Y² 為硫醯胺基團的式 15 化合物與其中 Y³ 為溴乙醯基團的式 16 化合物反應將得到其中 G 為噻唑環的式 14 化合物。合成文獻描述了許多用於形成 5 員

雜芳環和部分飽和的 5 員雜環（如 G-1 至 G-59）的通用方法；參見（例如）*Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, 第 4-6 卷, A. R. Katritzky 和 C. W. Rees（主編），Pergamon Press, Oxford, 1984; *Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, 第 2-4 卷，A. R. Katritzky, C. W. Rees 和 E. F. V. Scriven（主編），Pergamon Press, New York, 1996；和系列叢書 *The Chemistry of Heterocyclic Compounds*, E. C. Taylor（編輯），Wiley, Oxford。式 15 的中間體（其中 X 為 X¹, Y² 為 Br、I、甲磺酸根或三氟甲磺酸根）用於製備用於交叉偶聯反應的有機試劑也已經有所描述；參見（例如）S. Bellotte, *Synlett* 1998, 379-380 和 Nakamura 等人, *Synlett* 2005, 1794-1798。本領域技術人員可以容易地決定 Y² 與 Y³ 所需的合適官能基團來構造所需的雜環 G 環。式 16 和式 17 化合物是已知的且可通過本領域已知的方法製備。

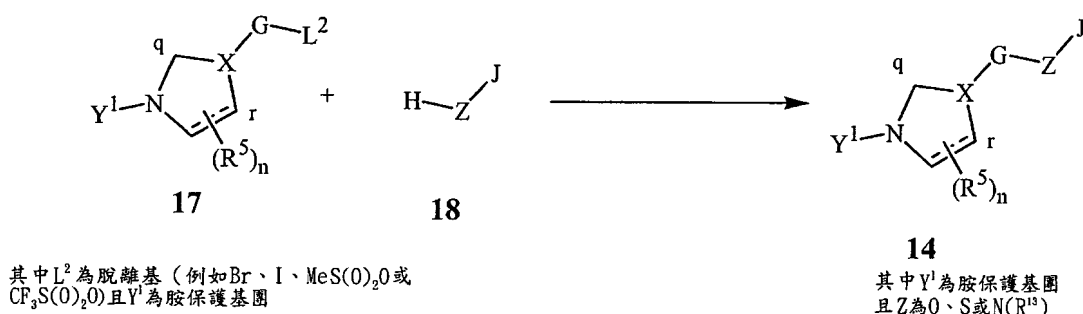
方案 10



其中 Z 為 O、S 或 N(R¹³) 的式 14 化合物可以如方案 11 所示，在存在鹼的情況下，通過用式 18 化合物置換連接至式 17 上的合適脫離基 L²（例如 Br、I 或磺酸

根如 $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2\text{O}$ 或 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2\text{O}$) 而製備。合適的鹼包括氫化鈉或碳酸鉀。該反應典型是在約 0 至 80 °C 的溫度下，在諸如 *N,N*-二甲基甲醯胺或乙腈之類的溶劑中進行。式 17 化合物中的合適脫離基包括 (例如) 溴、碘、甲磺酸根 ($\text{OS}(\text{O})_2\text{CH}_3$)、三氟甲磺酸根 ($\text{OS}(\text{O})_2\text{CF}_3$) 等。式 17 化合物可通過本領域已知的通用方法，從其中 L^2 為 OH 的式 17 對應化合物製備。式 18 化合物是已知的並且可通過本領域已知的通用方法製備。

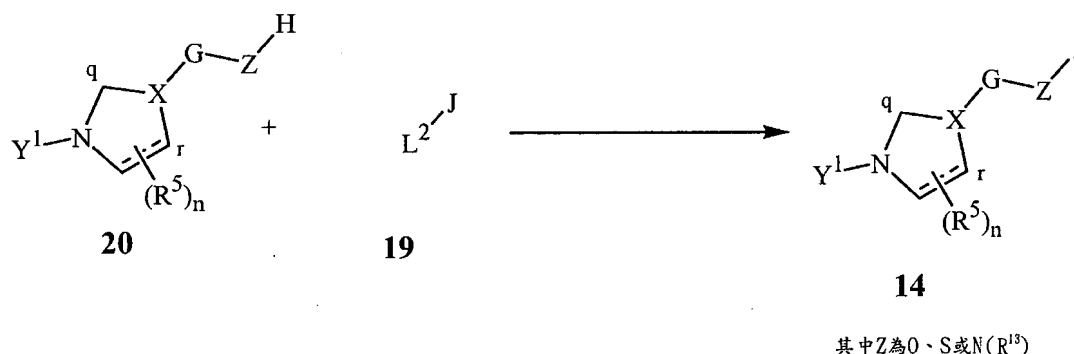
方案 11



其中 Z 為 O、S 或 $\text{N}(\text{R}^{13})$ 的式 14 化合物還可以如方案 12 所示，在存在鹼的情況下，通過用式 20 化合物置換連接至式 19 上的合適脫離基 L^2 (例如 Br、I、磺酸根如 $\text{MeS}(\text{O})_2\text{O}$ 或 $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2\text{O}$) 而製備。合適的鹼包括氫化鈉或碳酸鉀。該反應典型是在約 0 至 80 °C 的溫度下，在諸如 *N,N*-二甲基甲醯胺或乙腈之類的溶劑中進行。

式 19 化合物可通過本領域已知的通用方法，從其中 L^2 為 OH 的式 19 對應化合物製備。許多式 19 化合物是已知的並且可通過本領域已知的通用方法製備。

方案 12

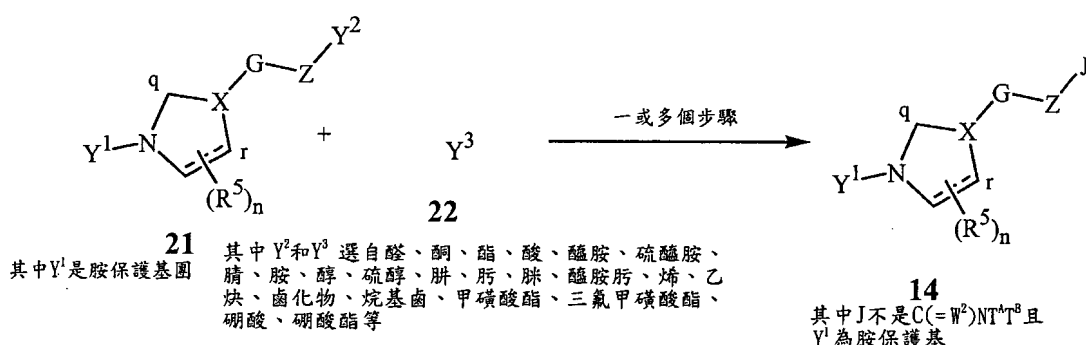


其中L²為脫離基(e. g. Br、I、MeS(O)₂O或CF₃S(O)₂O)且Y¹為胺保護基團

如方案 13 所示，其中 J 不是 C(=W²)NT^AT^B 的式 14 化合物也可通過使式 21 化合物與式 22 化合物反應而製備，官能團 Y² 和 Y³ 選自（但不限於）諸如醛、酮、酯、酸、醯胺、硫醯胺、腈、胺、醇、硫醇、脛、肟、脛、脛、醯胺肟、烯、乙炔、鹵化物、烷基鹵、甲磺酸酯、三氟甲磺酸酯、硼酸、硼酸酯等之類的部分，這些部分在合適的反應條件下，將使得能構造多種雜環 J 環。例如，其中 Y² 為氯肟部分的式 21 化合物與其中 Y³ 為烯類或乙炔的式 22 化合物在存在鹼的情況下反應，將得到其中 J 分別為異噁唑啉或異噁唑的式 14 化合物。合成文獻包括多種用於形成碳環和雜環以及環系統（例如 J-1 至 J-82）的通用方法；參見（例如）*Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, 第 4-6 卷，A. R. Katritzky 和 C. W. Rees（編輯），Pergamon Press, New York, 1984；*Comprehensive Heterocyclic Chemistry II*, 第 2-4 卷，A. R. Katritzky, C. W. Rees 和 E. F. Scriven（編輯），Pergamon Press, New York, 1996；系列叢書 *The*

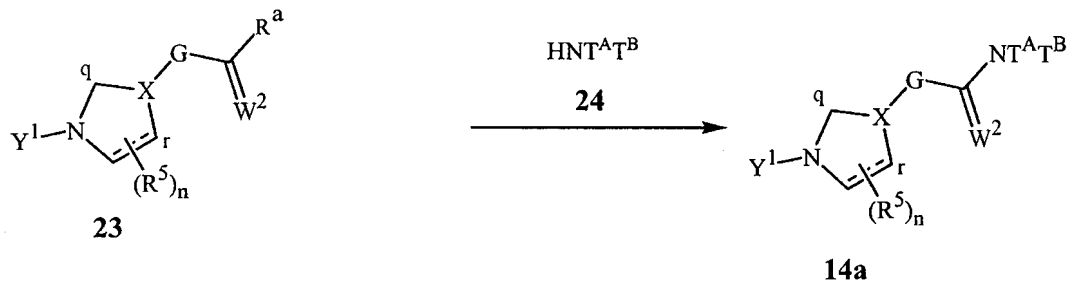
Chemistry of Heterocyclic Compounds, E. C. Taylor (編輯), Wiley, New York 和 *Rodd's Chemistry of Carbon Compounds*, 第 2-4 卷, Elsevier, New York。腓氧化物與烯烴環加成的一般方法在化學文獻中已經得到很好論證。相關參考文獻請參見 Lee, *Synthesis* **1982**, 6, 508-509 和 Kanemasa 等人, *Tetrahedron* **2000**, 56, 1057-1064 以及其中引用的參考文獻。本領域技術人員可以容易地決定合適的式 21 與式 22 化合物來構造尤為所欲的雜環 J 環。式 22 化合物是已知的並且可通過本領域已知的一般方法製備。

方案 13



如方案 14 所示，其中 W^2 為 O 的式 14a (其中 Z 為直接鍵，且 J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 的式 14) 化合物可通過使用類似所述用於方案 1 和 2 者的條件的醯胺鍵形成反應來製備。

方案 14



其中Y¹為胺保護基團，R^a為C¹或OH且W²為O

其中Z為直接鍵、J為C(=W²)NT^AT^B且W²為O

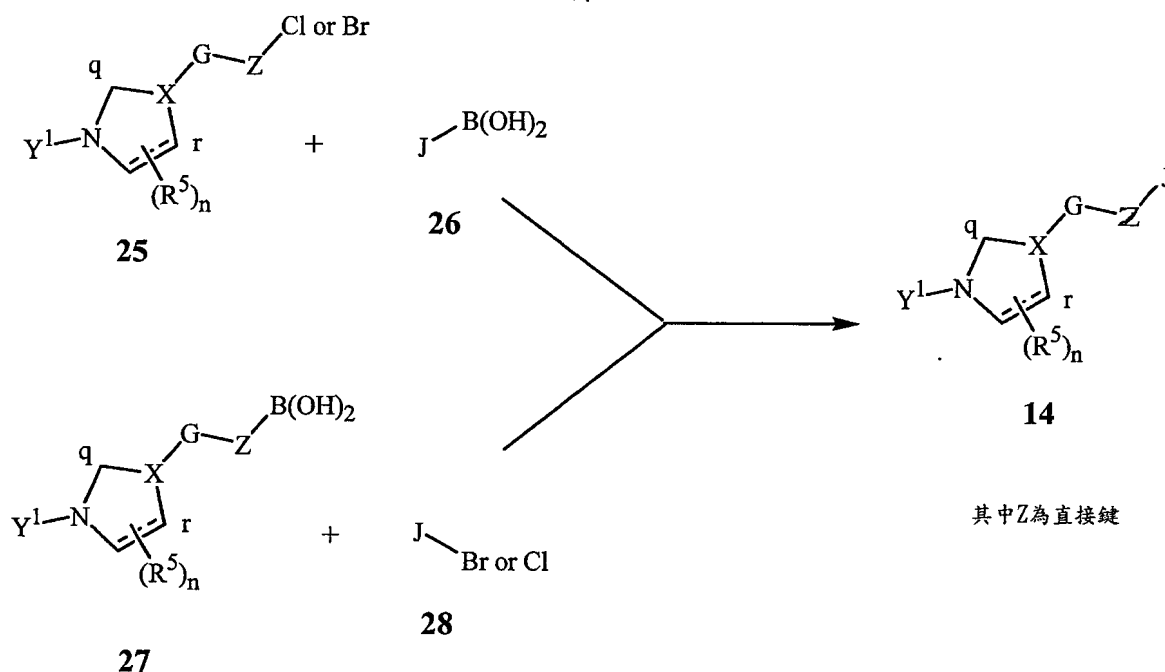
製備式 14a 化合物的備選方法揭露於 PCT 專利公開案第 WO 2007/014290 號。

在後續步驟中，使用多種標準的硫雜化試劑例如五硫化物或 2,4-雙(4-甲氧苯基)-1,3-二硫雜-2,4-二磷雜環丁烷-2,4-二硫化物（拉韋松試劑），將其中 W² 為 O 的式 14a 的醯胺轉換為其中 W² 為 S 的式 14a 的相應硫醯胺。

在如方案 15 所示的備選製備方法中，其中 Z 為直接鍵的式 14 化合物可利用熟知的 Suzuki 鈀催化交叉偶聯反應條件，使式 25 或 28 的鹵化物（Br 或 Cl）與式 26 或 27 的硼酸偶聯而製備。許多催化劑可用於 Suzuki 反應；尤為有用的催化劑是四(三苯膦)鈀(0)與[1,1'-雙(二苯基膦基)二茂鐵]二氯鈀(II)。諸如四氫呋喃、乙腈、二乙醚和二噁烷之類的溶劑是合適的。Suzuki 反應及相關的偶聯方法為形成 G-J 鍵提供了許多備選方案。對於主要的參考文獻；請參見（例如）Zificsak 等人，*Tetrahedron* **2004**, *60*, 8991-9016。對於適用於合成 G-J 鍵的鈀催化交叉偶聯反應的全面綜述，請參見

Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist, J. J. Li 和 G. W. Gribble (編輯), Elsevier, Oxford, UK, 2000。

方案 15



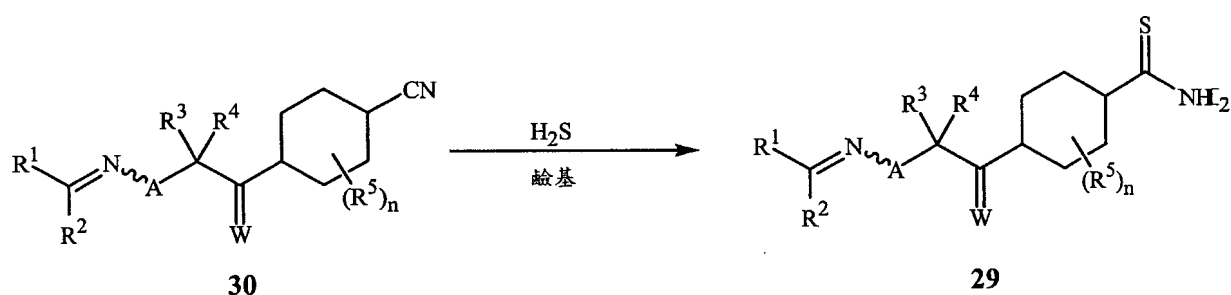
其中Y¹為胺保護基團
且Z為直接鍵

本領域技術人員將認識到，許多式 1 化合物可通過使用與上述方案 10 至 15 中所述的那些類似的方法直接製備，其中基團 Y¹ 被 (R¹)(R²)=N~AC(R³)(R⁴)C(=W)- 部分代替。因 Below 28: 其中 Y¹ 為胺保護基團且 Z 為直接鍵，與其中 Y¹ 被 (R¹)(R²)=N~AC(R³)(R⁴)C(=W)- 代替的式 15、17、20、21、23、25 和 27 對應的化合物是製備式 1 化合物的有用中間體。

製備其中 X 為 X¹ 的式 1 化合物的特別有用的中間體為式 29 的硫醯胺，其可如方案 16 所示，通過用硫化

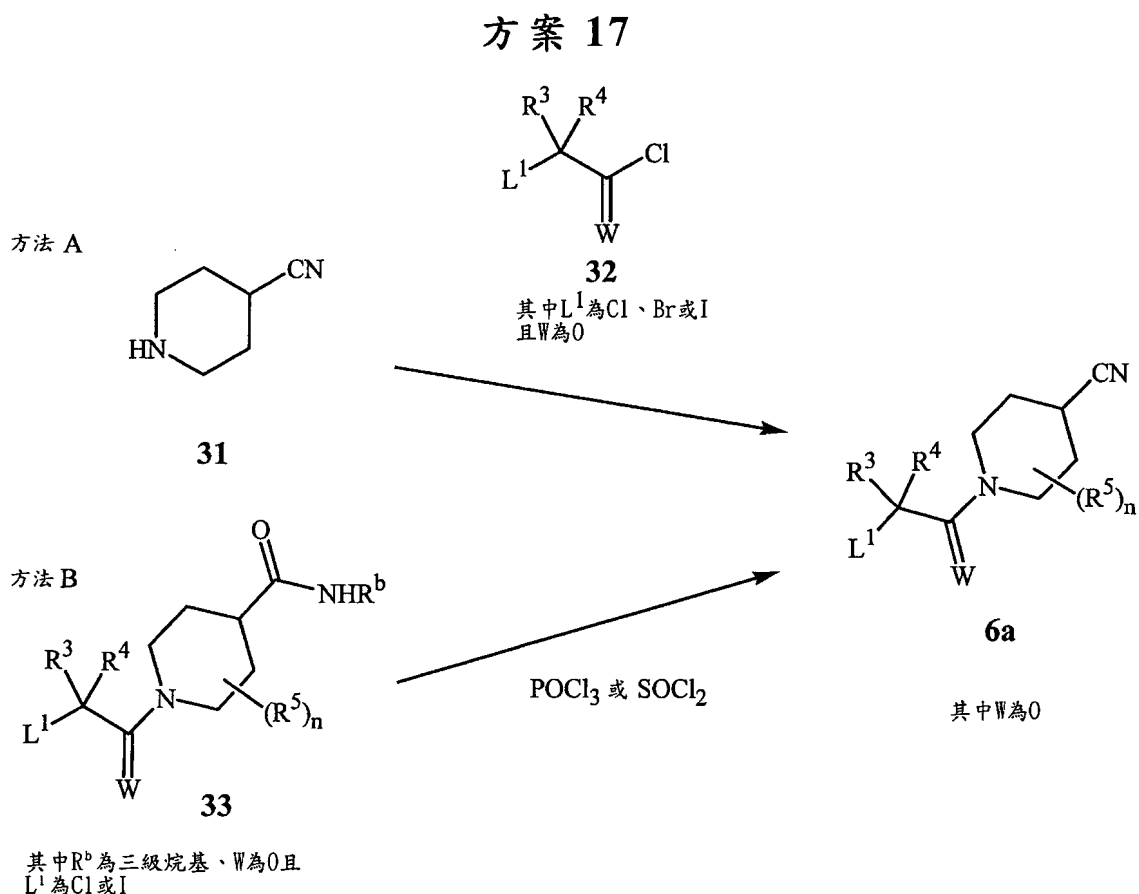
氫處理而製備自相應式 30 的脛。方案 16 的反應可通過在存在諸如吡啶、二乙胺或二乙醇胺之類的胺的情況下，使式 30 化合物與硫化氫接觸而進行。作為另外一種選擇，可將硫化氫以其二硫鹽的形式並組合鹼金屬或氫使用。這種類型的反應在文獻中得到很好論證；參見（例如）歐洲專利第 EP 696581 號。

方案 16



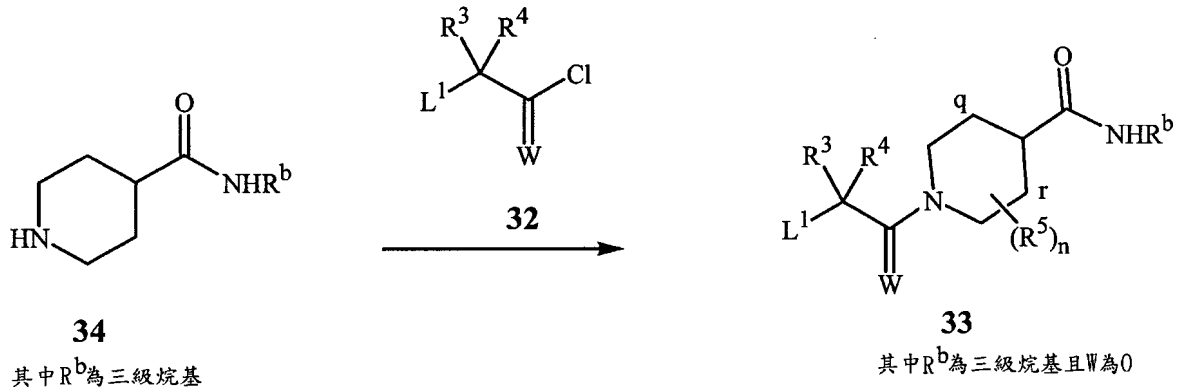
式 30 化合物可通過使用類似所述於方案 1、2、3、4 或 5 者的方法製備，其中 X 為 X¹，並且式 3、6、7 和 9 化合物中的 G-Z-J 被氰基代替。尤為有用的是類似方案 3 的方法其中式 6 係用式 6a（其中 X 為 X¹ 且 G-Z-J 用氰基代替）的化合物代替。式 6a 化合物通常是在存在鹼的情況下，將式 31 的氰基哌啶與合適的式 32 的醯基氯接觸而製備。較佳的條件涉及使用諸如鹼金屬或鹼土金屬碳酸鹽、碳酸氫鹽或磷酸鹽之類的無機鹼的水溶液和諸如甲苯、乙酸乙酯或 1,2-二氯乙烷之類的非水混溶性有機溶劑。式 6a 化合物亦可通過使 R^b 為三級烷基例如 C(Me)₃ 的式 33 化合物在合適的溶劑中接觸醯胺去水試劑例如亞硫醯氯或磷醯氯而製備，如方案 17 的方

法 B 所示。對這種轉化來說特別較佳的溶劑是 *N,N*-二烷基醯胺例如 *N,N*-二甲基甲醯胺。該反應通常是通過在加料期間反應可快速進行的溫度（溫度通常為約 35 至 55 °C 間），將 0.9 至 2 當量（較佳 1.1 當量）的磷氧氯化物或亞硫醯氯加至式 33 化合物與 0.5 至 10 重量份溶劑的混合物而進行。



如方案 18 所示，式 33 化合物可通過與方案 17 中的方法 A 類似的方法來製備。

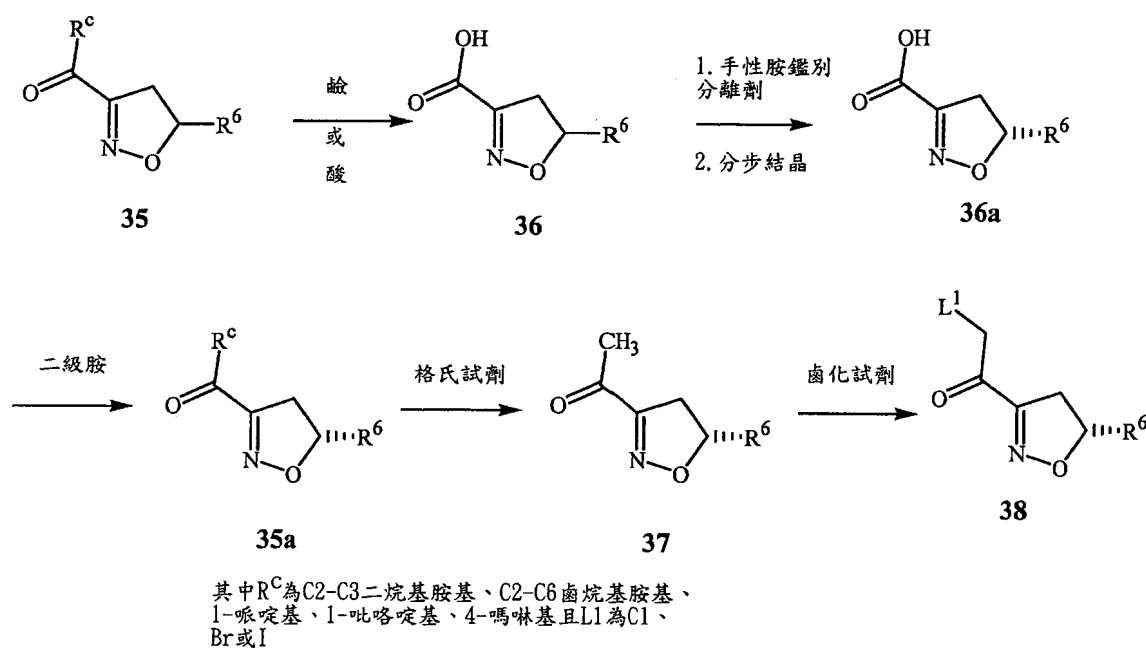
方案 18



從 4-氰基吡啶或異煙酸製備式 34 化合物的方法是本領域已知的；參見例如德國專利第 DE 3537762 號關於從氰基吡啶和三級丁醇製備 *N*-三級丁基吡啶甲醯胺的內容以及 Nelsen 等人，*J. Org. Chem.*, 1990, 55, 3825 關於用鉑催化劑氫化 *N*-甲基異煙醯胺的內容。

式 38 的鹵酮是用於製備其中 J 是（例如）選自如示例 A 中所示的 J-29-1 至 J-29-12 的式 1 的某些手性化合物的特別有用的中間體。值得注意的式 38 (*R*) 構型鹵酮中間體在與式 39 的硫醯胺偶聯後（在偶聯後可能需要進一步的步驟以得到式 1 化合物），提供較高殺真菌活性的式 1 最終產物。式 38 的鹵酮可如方案 19 所示，通過多步反應序列製備。

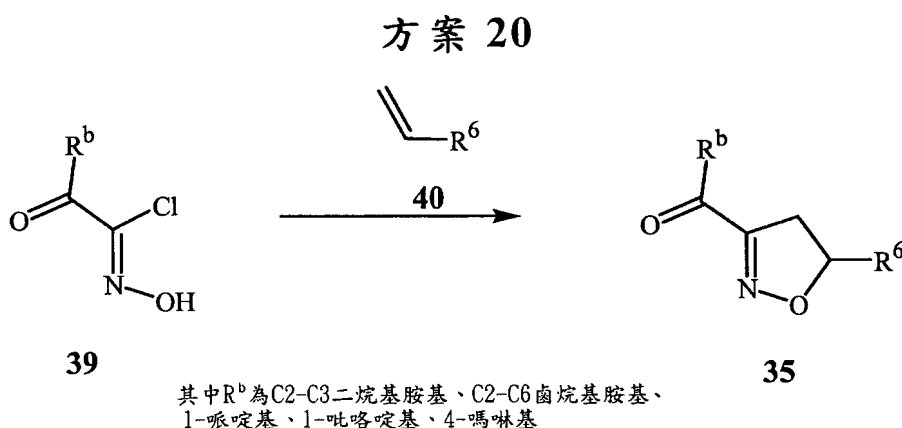
方案 19



在方案 19 中，將式 35 化合物根據熟知的方法在鹼性或酸性條件下進行水解，以提供式 6 化合物。例如，在約 25 至 45 °C 的溫度下，用氫氧化鈉（較佳為相對於式 35 化合物莫耳數稍微過量的氫氧化鈉）在合適溶劑（例如甲醇或四氫呋喃）中處理式 35 化合物，而提供式 36 化合物的鹽類。可通過將反應混合物的 pH 調節至約 1 至 3，然後過濾反應混合物或用有機溶劑（任選在反應混合物濃縮後進行）萃取反應混合物來分離式 36 的羧酸產物。式 36 的外消旋化合物可通過與合適的手性胺鑑別分離劑反應以形成非鏡像異構物鹽，而後用經典分步結晶法來拆分以提供式 36a 化合物（純鏡像異構物或鏡像異構物富集的）。合適的手性胺鑑別分離劑例如金雞納寧、二氫金雞納寧或它們的混合物。比率為約 85:15 的金雞納寧-二氫金雞納寧混合物是特別有用的，因為其可提供例如作為溶解度較小的鹽的(R)-構型

的式 36a 羧酸（其中 R^6 是經取代的苯基）。此外，這些手性胺鹼在商業來源上是易得的。使用類似於方案 1 或 2 所述者的醯胺鍵將 36a 化合物轉換為式 35a 的手性醯胺。式 37 的酮可這樣製備：首先使對應的式 35a 的醯胺（純鏡像異構物形式或鏡像異構物富集的混合物）與一莫耳當量的格氏試劑如甲基鎂鹵化物在合適的溶劑或溶劑混合物（例如四氫呋喃和甲苯）中於約 0 至 20 °C 的溫度下反應。式 37 的酮可通過用水性酸驟冷反應混合物、用有機溶劑萃取以及濃縮來分離。式 37 的酮可直接使用而無須進一步純化或用所屬領域已知的標準方法來純化。用諸如磺醯氯或溴之類的試劑鹵化的式 37 的化合物以得到式 38 的鹵酮。式 38 的鹵酮可通過從諸如己烷或甲醇之類的溶劑結晶而純化，或可無需進一步純化而用於與硫醯胺的縮合反應。

式 35 的異噁唑甲醯胺可如方案 20 所示，通過對應的式 39 的異脛肟醯氯與式 40 的烯烴衍生物環加成而製備。



在方案 20 的方法中，使式 39 化合物和式 40 化合物在存在鹼的情況下接觸，接觸方式使得式 39 的異羥肟醯氯的水解或二聚化程度最小。在一種典型的方法中，將鹼（其可以是三級胺鹼例如三乙胺或無機鹼例如鹼土金屬碳酸鹽、碳酸氫鹽或磷酸鹽）與式 40 化合物混合，並逐漸加入式 39 化合物，在環加成可以相對較快的速率下進行的溫度下實現，通常在 5 和 25 °C 之間。或者，可將鹼逐步加至另兩種組分（式 39 化合物和式 40 化合物）中。當式 39 異羥肟醯氯在反應介質中基本上不溶解時，這種可供選擇的方法是較佳的。反應介質中的溶劑可以是水或惰性溶劑例如甲苯、己烷或甚至是過量使用的烯烴。可通過過濾或用水洗滌，然後蒸發溶劑來從鹽共產物分離產品。可通過結晶純化粗產物，或該粗產物可直接用於方案 19 的方法中。式 35 化合物是對應的式 37 甲基酮和式 38 鹵甲基酮的有用前體，並且還可如方案 19 所示，通過水解、拆分、甲基酮合成和鹵化，用於製備拆分的式 37 和 38 的鏡像異構物。

已經認識到，上面關於製備式 1 化合物所述的某些試劑和反應條件可能會與中間體中存在的某些官能團不相容。在這些情況中，在合成中整合進保護/去保護步驟或官能團互換將有助於獲得所需產物。保護基團的使用和選擇對化學合成領域的技術人員來說將是顯而易見的（參見例如 T. W. Greene 和 P. G. M. Wuts, *Protective Groups in Organic Synthesis*, 第 2 版；Wiley: New York, 1991）。本領域技術人員將認識到，在某些情況下，將給定試劑如其在任何單獨方案中所示引入後，

可能有必要執行未詳細描述的額外常規合成步驟來完成式 1 化合物的合成。本領域技術人員還將認識到，可能有必要以不同於製備式 1 化合物所提出的具體順序所包含的步驟執行上述方案中所示步驟的組合。

本領域技術人員還將認識到，本文描述的式 1 化合物和中間體可發生多種親電反應、親核反應、自由基反應、有機金屬反應、氧化反應和還原反應，以添加取代基或使現有取代基改性。

無需進一步的詳盡細節，據信利用先前的描述，本領域技術人員可就其最大程度對本發明進行利用。因而，下面的「實例」應被理解為僅僅是示例性的，並且不以任何方式限制本公開。下面「實例」中的步驟示出了整個合成轉化中每步的工序，並且每步的原料可能不一定已通過其工序在其他「實例」或「步驟」中描述了具體製備操作製備。除色譜溶劑混合物或另外指明的地方外，百分比是以重量計。除非另外指明，否則關於色譜溶劑混合物的份數和百分比是以體積計。¹H NMR 譜是以相對於四甲基矽烷向低場偏移的 ppm 計；「s」指單峰，「d」指雙重峰，「t」指三重峰，「q」指四重峰，「m」指多重峰，「dd」指雙重峰的雙重峰，「dt」指三重峰的雙重峰，「br s」指寬單峰，而「br m」指寬多峰。

實例 1

2,2,2-三氟乙醛 *O*-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]肟（化合物 3）的製備

步驟 A： 5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-N,N-二甲基-3-異噁唑甲醯胺的製備

將 2-(二甲基胺基)-N-羥基-2-側氧乙亞胺醯氯(94.0 g, 0.62 mol)和氯苯(275 g)中的 2,6-二氟苯乙烯(84.0 g, 0.60 mol)溶液倒入配備有機械攪拌器、溫度計和加料漏斗的 1000-mL 圓底燒瓶中。讓反應混合物冷卻至 10 °C，然後在 1 小時期間逐滴加入水(350 mL)中的碳酸氫鉀(70 g, 0.70 mol)溶液，同時將反應溫度保持在 10 至 15 °C 之間。當對反應混合物進行的氣相色譜分析表明剩下約 3%的 2-(二甲基胺基)-N-羥基-2-側氧-乙亞胺醯氯時，向該混合物加入水(200 mL)，並分離層。用水(300 mL)洗滌有機相並在減壓下濃縮。向所得殘餘物中加入甲苯，並在減壓下再度濃縮該混合物，從而得到油狀標題化合物(144 g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): δ 3.1 (s, 3H), 3.3 (s, 3H), 3.4 (m, 1H), 3.57 (m, 1H), 6.0 (m, 1H), 6.95 (m, 2H), 7.35 (m, 1H)。

步驟 B： 1-(4,5-二氫-5-(2,6-二氟苯基)-3-異噁唑基)乙酮的製備

向配備有溫度計和加料漏斗的 1000-mL 燒瓶倒入 5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-N,N-二甲基-3-異噁唑甲醯胺(即步驟 A 的產物)(80.0 g, 0.31 mol)和甲苯(320 mL)。將反應混合物冷卻至 -5 °C，並逐滴加入甲基溴化鎂溶液(四氫呋喃中為 3.0 M, 120 mL, 0.36 mmol)，同時將反應溫度保持在 -10 至 -5 °C 之間。當對反應混合物進行

的氣相色譜分析表明剩下約 2% 的 5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-*N,N*-二甲基-3-異噁唑甲醯胺時，將反應混合物傾注入濃鹽酸(80 mL)和水(320 mL)的攪拌溶液中，同時保持混合物溫度在 10 至 30 °C 之間。分離有機層並將其用飽和氯化鈉水溶液(80 mL)洗滌，在減壓下濃縮。將所得油狀物從己烷(100 mL)結晶，通過過濾收集，用己烷洗滌。所得固體在 23 °C 下在真空烘箱中乾燥過夜，從而得到標題化合物的蠟質灰白色固體(65 g)，熔點為 47-50 °C。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): δ 2.6 (s, 3H), 3.3 (m, 1H), 3.5 (m, 1H), 6.1 (m, 1H), 6.9 (m, 2H), 7.3 (m, 1H)。

步驟 C： 2-溴-1-(4,5-二氫-5-(2,6-二氟苯基)-3-異噁唑基)乙酮的製備

向配備有機械攪拌器、溫度計、加料漏斗和清洗器的 500-mL 燒瓶倒入 1-(4,5-二氫-5-(2,6-二氟苯基)-3-異噁唑基)乙酮(即步驟 B 的產物)(60.0 g, 0.27 mmol)和二氯甲烷(130 mL)。將反應混合物在 33 °C 下加熱，並通過加料漏斗逐滴加入二氯甲烷(100 mL)中的溴溶液(39.2 mL, 0.24 mol)。已經加入約 5 mL 溴溶液後，停止加入並在 33 °C 下攪拌反應混合物約 10 分鐘，期間反應混合物的顏色由紅色變成黃色。將反應混合物冷卻至 5 °C，並在 90 分鐘期間逐滴加入剩餘的溴溶液。加料完成後，用水性亞硫酸氫鈉溶液(100 mL 水中為 3.5 g)洗滌反應混合物，溶液分層後減壓濃縮有機層。將己烷

加入所得殘餘物，並且將混合物過濾並用己烷潤洗從而得到標題化合物的棕色固體(73 g)，其無需進一步純化便可使用。

步驟 D： 4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]哌啶的製備

將 1-三級丁氧基羰基哌啶-4-硫甲醯胺(7.33 g, 30 mmol)和 2-溴-1-(4,5-二氫-5-(2,6-二氟苯基)-3-異噁唑基)乙酮(即步驟 C 的產物)(9.12 g, 30 mmol)在丙酮(100 mL)中的混合物在 45°C 下加熱 3 小時，然後在室溫下攪拌過夜。將反應混合物濃縮，將所得殘餘物溶解於二氯甲烷(100 mL)和三氟乙酸(40 mL)中，在室溫下攪拌 3 小時，然後減壓濃縮。將所得油狀物溶解於鹽酸水溶液(0.5 N, 200 mL)中並用乙酸乙酯萃取。通過加入氫氧化鈉水溶液(在水中為 10%)使有機層鹼化。分離有機層，然後將其用飽和氯化鈉水溶液洗滌、用硫酸鎂乾燥、過濾並減壓濃縮，從而得到標題化合物的黏稠琥珀酸油狀物(8.62 g，重量包括殘留的乙酸乙酯)。

將更多氫氧化鈉水溶液(在水中為 50%)加入鹽酸溶液通過加入來鹼化，然後用乙酸乙酯萃取混合物。將有機層用飽和氯化鈉水溶液洗滌、用硫酸鎂乾燥，過濾並減壓濃縮，從而得到標題化合物的油狀物(1.33 g，重量包括殘留的乙酸乙酯)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 1.70-1.80 (m, 2H), 1.87 (br s, 1H), 2.22 (m, 2H), 2.77 (m, 2H), 3.18 (m, 3H), 3.62 (m, 1H),

3.80 (m, 1H), 6.05 (m, 1H), 6.92 (m, 2H), 7.30 (m, 1H), 7.64 (s, 1H)。

步驟 E： 2,2,2-三氟乙醛 *O*-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]肼的製備

讓 *O*-(羧甲基)脛胺半鹽酸鹽(5.5 g, 25 mmol)和 2,2,2-三氟-1,1-乙二醇 (10 g, 75 mmol, 水中的 75%溶液) 的混合物靜置。4 天後，將該反應混合物用二氯甲烷稀釋、用水洗滌、用硫酸鎂乾燥、過濾並減壓濃縮，從而得到 2-[(2,2,2-三氟亞乙基)胺基]氧基]乙酸的白色粉末(6.5 g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): δ 4.80 (s, 2H), 7.58 (m, 1H), 10.4 (br s, 1H)。

將 2-[(2,2,2-三氟亞乙基)胺基]氧基]乙酸 (如上段所述方式準備) (565 mg, 3.3 mmol)、4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]哌啶 (即步驟 D 的產物) (1.50 g, 3.0 mmol)、*N*3-(乙基碳二亞胺)-*N*1,*N*1-二甲基-1,3-丙二胺鹽酸鹽(633 mg, 3.3 mmol)、1-羥基苯并三唑(40.5 mg, 0.30 mmol)和三乙胺(460 μL , 3.3 mmol)在二氯甲烷(8 mL)中的混合物在室溫下攪拌。3 小時後，用二氯甲烷稀釋反應混合物，並用水、鹽酸(1 N)、水、飽和碳酸氫鈉水溶液和飽和氯化鈉水溶液洗滌。將有機層用硫酸鎂進行乾燥、過濾並減壓濃縮，從而得到黃色油狀物(1.3 g)。將該油狀物從乙酸甲酯(5 mL)結

晶，從而得到標題化合物（本發明化合物）的白色固體（0.55 g），熔點為 123-126 °C。

將戊烷(10 mL)加至該乙酸甲酯濾液中並過濾該混合物。將所得固體從甲醇(3 mL)中結晶，以得到更多的標題化合物白色固體(455 mg)，熔點為 124-127 °C。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): δ 1.75-1.90 (m, 2H), 2.15-2.27 (m, 2H), 2.88 (m, 1H), 3.22 (m, 1H), 3.32 (m, 1H), 3.63 (m, 1H), 3.75-3.85 (m, 2H), 4.62 (m, 1H), 4.90 (m, 2H), 6.07 (m, 1H), 6.92 (m, 2H), 7.30 (m, 1H), 7.60 (m, 1H), 7.66 (s, 1H)。

實例 2

環戊酮 *O*-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噁唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]肟（化合物 5）的製備

步驟 A： 2-氯-1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噁唑基]-1-哌啶基]乙酮的製備

在 0°C 下，向 4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噁唑基]哌啶（即實例 1 步驟 D 的產物）(4.2 g, 12.0 mmol)和 *N,N*-二異丙基乙胺(1.63 g, 12.6 mmol)在二氯甲烷(25 mL)中的混合物加入 2-氯乙醯氯(1.43 g, 1.26 mmol)在二氯甲烷(3 mL)中的溶液，而後讓該反應混合物升溫至室溫。4 小時後，將反應混合物傾注到水中並且分層。將有機層用水性鹽酸溶液(1 N)、飽和碳酸氫鈉水溶液和飽和氯化鈉水溶液洗滌、用硫酸鎂乾燥、過濾並減壓濃縮。通過在矽膠上進行的中壓液相色譜

(己烷中 0 至 100%梯度的乙酸乙酯作為洗脫液) 對所得殘餘物進行純化，從而得到標題化合物的棕褐色固體 (2.8 g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): δ 1.78-1.97 (m, 2H), 2.18-2.31 (m, 2H), 2.86-2.95 (t, 1H), 3.26-3.39 (m, 2H), 3.60-3.86 (m, 2H), 3.95-4.02 (d, 1H), 4.04-4.16 (m, 2H), 4.57-4.62 (d, 1H), 6.07-6.12 (m, 1H), 6.09-6.12 (m, 2H), 7.26-7.36 (m, 1H), 7.66 (s, 1H)。

步驟 B： 環戊酮 *O*-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基] 肼的製備

在 0°C 下向氫化鈉 (0.024 g, 0.60 mmol, 在礦物油中為 60%) 在四氫呋喃 (3 mL) 中的混合物加入環戊酮肼 (49.57 mg, 0.50 mmol) 在四氫呋喃 (2 mL) 中的溶液。在 0°C 下攪拌該反應混合物 30 分鐘，然後加入 2-氯-1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]乙酮 (即步驟 A 的產物) (0.19 g, 0.45 mmol) 在四氫呋喃 (2 mL) 中的溶液。讓該反應混合物升溫至室溫。2 小時後，將水 (5 mL) 緩慢加入該反應混合物中並用乙酸乙酯萃取該所得混合物。將有機層用硫酸鎂乾燥、過濾並減壓濃縮。通過在矽膠上進行的中壓液相色譜 (己烷中 0 至 100%梯度的乙酸乙酯作為洗脫液) 對所得殘餘物進行純化，從而得到標題化合物 (本發明化合物) 的琥珀色油狀物 (0.162 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 1.60-1.70 (m, 2H), 1.70-1.84 (m, 4H), 2.12-2.24 (m, 2H), 2.32-2.41 (m, 2H), 2.42-2.52 (m, 2H), 2.79-2.89 (m, 1H), 3.18-3.26 (m, 1H), 3.26-3.37 (m, 1H), 3.60-3.67 (m, 1H), 3.73-3.83 (m, 1H), 3.98-4.03 (m, 1H), 4.60-4.64 (m, 1H), 4.71 (s, 2H), 6.03-6.13 (m, 1H), 6.88-6.96 (m, 2H), 7.25-7.36 (m, 1H), 7.63 (s, 1H)。

實例 3

N-甲基-*N*-[(1*R*)-1-苯乙基]-2-[1-[2-[(2,2,2-三氟亞乙基)胺基]氧基]乙醯基]-4-哌啶基]-4-噻唑甲醯胺(化合物 31)的製備

向 1,1-二甲基乙基 4-[4-[[甲基[(1*R*)-1-苯乙基]胺基]羰基]-2-噻唑基]-1-哌啶羧酸酯(2.0 g, 4.65 mmol) (對於製備方法, 參見 PCT 專利公開申請案第 WO 2007/014290 號) 在二乙醚中的混合物加入鹽酸 (在二乙醚中為 2 N, 23 mL)。將該反應混合物在室溫下攪拌 3 小時, 然後通過過濾收集固體物質, 從而得到 *N*-甲基-*N*-[(1*R*)-1-苯乙基]-2-(4-哌啶基)-4-噻唑甲醯胺鹽酸鹽(1.2 g)。將 *N*-甲基-*N*-[(1*R*)-1-苯乙基]-2-(4-哌啶基)-4-噻唑甲醯胺鹽酸鹽(0.11 g, 0.30 mmol)、(2-[(2,2,2-三氟亞乙基)胺基]氧基]乙酸(通過實例 1 步驟 E 中所述的方法製備) (62 mg, 0.36 mmol)、*N*-(3-二甲基胺丙基)-*N'*-乙基碳二亞胺鹽酸鹽(81 mg, 0.42 mmol)、*N*-羥基苯并三唑(5 mg)和三乙胺(0.10 mL, 0.72 mmol)在乾二氯甲烷(8 mL)中的混合物在室溫下攪拌 3 小時。將反應混合物用

二氯甲烷稀釋，然後用水、鹽酸(0.1 N)、水、飽和碳酸氫鈉水溶液和飽和氯化鈉水溶液洗滌，並用硫酸鎂乾燥、過濾和減壓濃縮，從而得到標題化合物（本發明化合物）的黏稠油狀物(130 mg)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 1.60-1.90 (br m, 5 H), 2.10-2.25 (br m, 2 H), 2.7-3.0 (br m, 4H), 3.15-3.30 (br m, 2 H), 3.7-3.85 (br m, 1 H), 4.4-4.6 (br m, 1H), 4.88 (br s, 2 H), 5.7-6.2 (br m, 1H), 7.25-7.40 (m, 5H), 7.60 (m, 1H), 7.84 (s, 1H)。

實例 4

2,2,2-三氟乙醛 2-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]-2-甲基脞（化合物 35）的製備

步驟 A： 1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-(1-甲基胍基)乙酮的製備

在 0°C 下向甲基胍(532 μL , 10.0 mmol)在四氫呋喃(1 mL)中的混合物逐滴加入 2-氯-1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]乙酮（即實例 2 步驟 A 的產物）(425 mg, 1.0 mmol)在四氫呋喃(5 mL)中的溶液。在室溫下將該反應混合物攪拌過夜，然後減壓濃縮。將所得殘餘物溶解於二氯甲烷中，用水和飽和氯化鈉水溶液洗滌、用硫酸鎂乾燥、過濾並減壓濃

縮，從而得到標題化合物油狀物（包括殘餘四氫呋喃，重 0.59 g），其可使用而無需進一步純化。

步驟 B： 2,2,2-三氟乙醛 2-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]-2-甲基脞的製備

向 1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-(1-甲基胼基)乙酮(即步驟 A 的產物)(包括殘餘四氫呋喃，重 0.29 g) 在甲醇(3 mL) 中的混合物加入 2,2,2-三氟-1,1-乙二醇 (209 mg, 1.35 mmol, 在水中為 75%)。將該反應混合物在室溫下攪拌過夜，然後用二氯甲烷稀釋。將有機層用水和飽和氯化鈉水溶液洗滌、用硫酸鎂乾燥、過濾並減壓濃縮。通過在矽膠上進行的中壓液相色譜（己烷中 0 至 100%梯度的乙酸乙酯作為洗脫液）對所得殘餘物進行純化，從而得到標題化合物（本發明化合物）的油狀物(0.085 g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 1.75-1.90 (m, 2H), 2.15-2.27 (m, 2H), 2.82 (m, 1H), 2.99 (s, 3H), 3.20 (m, 1H), 3.33 (m, 1H), 3.62 (m, 1H), 3.75-3.95 (m, 2H), 4.29 (m, 2H), 4.58 (m, 1H), 6.07 (m, 1H), 6.35 (m, 1H), 6.90 (m, 2H), 7.30 (m, 1H), 7.66 (s, 1H)。

實例 5

2,2,2-三氟乙酸 2-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]-2-甲基胍(化合物 36) 的製備

在 0°C 下向 1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-(1-甲基胍基)乙酮(即實例 4 步驟 A 的產物)(包括殘餘四氫呋喃, 重 0.29 g)和三乙胺(103 μ L, 0.74 mmol)在二氯甲烷(2 mL)中的混合物加入三氟乙酸酐(0.097 mL, 0.70 mmol)。讓反應混合物升溫至室溫、攪拌過夜, 然後用二氯甲烷稀釋。將有機層用水和飽和氯化鈉水溶液洗滌、用硫酸鎂乾燥、過濾並減壓濃縮。通過在矽膠上進行的中壓液相色譜(己烷中 0 至 100%梯度的乙酸乙酯作為洗脫液)對所得殘餘物進行純化, 從而得到標題化合物(本發明化合物)的白色泡沫狀固體(0.10 g)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3) δ 1.75-1.90 (m, 2H), 2.15-2.27 (m, 2H), 2.80-2.90 (m, 4H), 3.20 (m, 1H), 3.33 (m, 1H), 3.62 (m, 1H), 3.75-3.90 (m, 4H), 4.60 (m, 1H), 6.07 (m, 1H), 6.92 (m, 2H), 7.30 (m, 1H), 7.65 (m, 1H), 9.45 (s, 1H)。

實例 6

N-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙氧基]-2,2,2-三氟乙醯胺(化合物 38) 的製備

步驟 A： *N*-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙氧基]-2,2-二甲基丙醯胺的製備

在 0°C 下向氫化鈉 (80 mg, 2.0 mmol, 在礦物油中為 60%) 和 *N,N*-二甲基甲醯胺的混合物加入 1,1-二甲基乙基 *N*-羥基胺基甲酸酯 (146 mg, 1.1 mmol) 在 *N,N*-二甲基甲醯胺 (1 mL) 中的溶液。在 0°C 下攪拌該反應混合物 30 分鐘，然後加入 2-氯-1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]乙酮 (即實例 2 步驟 A 的產物) (0.43 g, 1.0 mmol) 在 *N,N*-二甲基甲醯胺 (2 mL) 中的溶液。讓反應混合物升溫至室溫並攪拌 2 小時，然後緩慢加入水 (5 mL)。用乙酸乙酯萃取該混合物，將有機層用檸檬酸溶液 (也稱為 2-羥基-1,2,3-丙烷三羧酸) (在水中為 20%) 和飽和碳酸氫鈉溶液洗滌、用硫酸鎂乾燥、過濾和減壓濃縮。通過在矽膠上進行的中壓液相色譜 (己烷中 0 至 100% 梯度的乙酸乙酯作為洗脫液) 對所得殘餘物進行純化，從而得到標題化合物的油狀物 (0.37 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 1.47 (s, 9H), 1.8 (m, 2H), 2.2 (m, 2H), 2.85 (m, 1H), 3.20 (m, 1H), 3.30 (m, 1H), 3.60-3.67 (m, 1H), 3.75-3.83 (m, 1H), 4.57 (s, 2H), 4.60 (m, 1H), 6.03-6.13 (m, 1H), 6.88-6.96 (m, 2H), 7.25-7.36 (m, 1H), 7.66 (s, 1H), 8.19 (s, 1H)。

步驟 B： 2-(胺基氧基)-1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]乙酮的製備

向 *N*-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙氧基]-2,2-二甲基丙醯胺(即步驟 A 的產物)(0.37 g, 0.71 mmol)在甲醇(5 mL)中的混合物加入鹽酸溶液(在二乙醚中為 2 M, 3.6 mL)。3 小時後,將反應混合物在減壓下濃縮,並在二氯甲烷和飽和碳酸氫鈉水溶液之間分配。將有機層用硫酸鎂乾燥、過濾並減壓濃縮,從而得到標題化合物的泡沫狀白色固體(0.20 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 1.8 (m, 2H), 2.2 (m, 2H), 2.85 (m, 1H), 3.15 (m, 1H), 3.30 (m, 1H), 3.60-3.67 (m, 1H), 3.70-3.83 (m, 2H), 4.40 (s, 2H), 4.63 (m, 1H), 5.93 (br s, 2H), 6.10 (m, 1H), 6.88-6.96 (m, 2H), 7.25-7.36 (m, 1H), 7.66 (s, 1H)。

步驟 C： *N*-[2-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙氧基]-2,2,2-三氟乙醯胺的製備

在 0°C 下向 2-(胺基氧基)-1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]乙酮(即步驟 B 的產物)(0.20 g, 0.47 mmol)和三乙胺(0.073 mL, 0.52 mmol)在二氯甲烷(2 mL)中的混合物加入三氟乙酸酐(0.065 mL, 0.47 mmol)。讓反應混合物升溫至室溫並

攪拌過夜。將更多的三乙胺(0.095 mL, 0.68 mmol)和三氟乙酸酐(0.044 mL, 0.32 mmol)加入該反應混合物中。2小時後，將反應混合物用二氯甲烷稀釋，然後用鹽酸(0.1 N)、飽和碳酸氫鈉水溶液和飽和氯化鈉水溶液洗滌，並用硫酸鎂乾燥、過濾和減壓濃縮，從而得到標題化合物(本發明化合物)的油狀物(0.14 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 1.8 (m, 2H), 2.2 (m, 2H), 2.95 (m, 1H), 3.15 (m, 1H), 3.33 (m, 1H), 3.55-3.70 (m, 2H), 3.70-3.83 (m, 1H), 4.55 (m, 1H), 4.75 (s, 2H), 6.04 (m, 1H), 6.88-6.96 (m, 2H), 7.5 和 7.7 (m, 1H), 7.65 (s, 1H)。

實例 7

1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-(4,5-二氫-3,5-二甲基-1*H*-吡唑-1-基]乙酮
(化合物 40) 的製備

步驟 A： 4,5-二氫-3,5-二甲基-1*H*-吡唑-1-乙酸乙酯的製備

在室溫下將胍基乙酸乙酯鹽酸鹽(1.55 g, 10 mmol)、3-戊烯-2-酮(0.95 mL, 10 mmol)和碳酸氫鈉(1.00 g, 11.9 mmol)在乙醇(10 mL)中的混合物攪拌過夜。然後將反應混合物過濾並減壓濃縮。通過在矽膠上進行的中壓液相色譜(己烷中 0 至 100%梯度的乙酸乙酯作為洗脫液)對所得油狀物進行純化，從而得到標題化合物的黃色油狀物(0.26 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 1.27 (m, 6 H), 1.94 (s, 3H), 2.35 (m, 1H), 2.75 (m, 1H), 3.42 (m, 1H), 3.60-3.85 (m 2H), 4.20 (m, 2H)。

步驟 B： 4,5-二氫-3,5-二甲基-1*H*-吡唑-1-乙酸的製備

在室溫下將 4,5-二氫-3,5-二甲基-1*H*-吡唑-1-乙酸乙酯（即步驟 A 的產物）(0.26 g, 0.0014 mol)和氫氧化鋰(0.072 g, 3 mmol)在甲醇(2 mL)、四氫呋喃(2 mL)和水(2 mL)的溶液中的混合物攪拌過夜。將飽和氯化銨水溶液加入該反應混合物中，並將該混合物在減壓下濃縮。將所得殘餘物溶解於乙酸乙酯中，並減壓濃縮有機層，從而得到標題化合物的無色油狀物(0.10 g)。

^1H NMR (CDCl_3): δ 1.29 (d, 3 H), 1.97 (s, 3H), 2.37 (m, 1H), 2.77 (m, 1H), 3.3 (m, 1H), 3.5-3.8 (m 2H), 8.15 (m, 1H)。

步驟 C： 1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-(4,5-二氫-3,5-二甲基-1*H*-吡唑-1-基]乙酮的製備

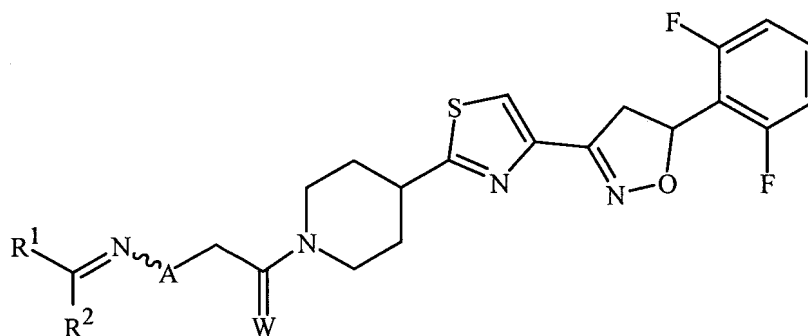
將 4,5-二氫-3,5-二甲基-1*H*-吡唑-1-乙酸（即步驟 B 的產物）(0.10 g, 0.64 mmol)、4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]哌啶（即實例 1 步驟 D 的產物）(175 mg, 0.5 mmol)、*N*3-(乙基碳二亞胺)-*N*1,*N*1-二甲基-1,3-丙二胺鹽酸鹽(191 mg, 1.0 mmol)、1-羥基苯并三唑(5 mg, 0.037 mmol)和三乙胺(0.14 mL, 1.0 mmol)

在二氯甲烷(4 mL)中的混合物在室溫下攪拌。6 小時後，將更多 *N*3-(乙基碳二亞胺)-*N*1,*N*1-二甲基-1,3-丙二胺鹽酸鹽(191 mg, 1.0 mmol)和三乙胺(0.14 mL, 1.0 mmol)加入該反應混合物中。3 天後，將該反應混合物用二氯甲烷稀釋，用飽和氯化銨水溶液洗滌並減壓濃縮。通過在矽膠上進行的中壓液相色譜(將己烷中 0 至 100%梯度的乙酸乙酯，接著為乙酸乙酯中 20%的甲醇作為洗脫液)對所得殘餘物進行純化，從而得到標題化合物(本發明化合物)的棕褐色固體(124 mg)。

$^1\text{H NMR}$ (CDCl_3): δ 1.25 (m, 3H), 1.65-1.90 (m, 2H), 1.93 (s, 3H), 2.10-2.25 (m, 2H), 2.35 (m, 1H), 2.80 (m, 2H), 3.15-3.45 (m, 3H), 3.50-4.05 (m, 4H), 4.30 (m, 1H), 4.66 (m, 1H), 6.07 (m, 1H), 6.92 (m, 2H), 7.30 (m, 1H), 7.66 (s, 1H)。

通過本文所描述的程序，連同本領域已知的方法，可製備如下表 1 至 21 的化合物。表中使用了如下縮寫，即：*t* 指三級，*s* 指二級，*n* 指正，*i* 指異，*c* 指環，Me 指甲基，Et 指乙基，Pr 指丙基，*i*-Pr 指異丙基，*c*-Pr 指環丙基，Bu 指丁基，*c*-Bu 指環丁基，CN 指氰基與 Ph 指苯基。

表 1



W 為 O。

W 為 O。

R ¹	R ²	A	R ¹	R ²	A
Me	Me	-O-	CF ₃	CF ₃	-O-
Me	Me	-S-	CF ₃	CH ₂ Cl	-O-
Me	Me	-NH-	CF ₃	Cl	-O-
Me	Me	-N(Me)-	CF ₃	Br	-O-
Me	Me	-CH ₂ -	CF ₃	MeO	-O-
Me	Me	-C(Me) ₂ -	CF ₃	EtO	-O-
Me	Me	-OCH ₂ -	CF ₃	CF ₃ O	-O-
Me	Me	-SCH ₂ -		-CH ₂ CH ₂ -	-O-
Me	Me	-NHCH ₂ -		-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	-O-
Me	Me	-N(Me)CH ₂ -		-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	-O-
Me	H	-O-		-CH ₂ (CH ₂) ₃ CH ₂ -	-O-
Et	H	-O-		-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ -	-O-
<i>n</i> -Pr	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-O-
<i>i</i> -Pr	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-O-
<i>n</i> -Bu	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Et	-O-
<i>i</i> -Bu	H	-O-	CF ₃ CH ₂	CN	-O-
<i>t</i> -Bu	H	-O-	CF ₃ CH ₂	CF ₃	-O-
己基	H	-O-	CF ₃ CH ₂	CH ₂ Cl	-O-
H	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Cl	-O-
CN	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Br	-O-
NH ₂	H	-O-	CF ₃ CH ₂	MeO	-O-
HC(=O)	H	-O-	CF ₃ CH ₂	EtO	-O-
HOC(=O)	H	-O-	CF ₃ CH ₂	CF ₃ O	-O-
H ₂ NC(=O)	H	-O-	Me	Et	-O-
CH ₂ =CH	Me	-O-	Me	<i>n</i> -Pr	-O-
CH ₂ =CHCH ₂	H	-O-	Me	<i>i</i> -Pr	-O-
CH CCH ₂	H	-O-	Me	CN	-O-
CF ₃	H	-O-	Me	CF ₃	-O-
CF ₃	Me	-O-	Me	CH ₂ Cl	-O-
CF ₃ CH ₂	H	-O-	Me	Cl	-O-
CF ₃ CH ₂	Me	-O-	Me	Br	-O-

W 為 O。

R ¹	R ²	A	R ¹	R ²	A
ClCH ₂ CH ₂	H	-O-	Me	MeO	-O-
<i>c</i> -Pr	H	-O-	Me	EtO	-O-
<i>c</i> -戊基	H	-O-	Me	CF ₃ O	-O-
<i>c</i> -己基	H	-O-	CF ₃	H	-S-
1-F- <i>c</i> -Pr	H	-O-	CF ₃	H	-NH-
CF ₂ =CF	H	-O-	CF ₃	H	-N(Me)-
<i>c</i> -PrCH ₂	H	-O-	CF ₃	H	-CH ₂ -
CH ₃ OCH ₂	H	-O-	CF ₃	H	-C(Me) ₂ -
CH ₃ SCH ₂	H	-O-	CF ₃	H	-OCH ₂ -
CH ₃ S(=O)CH ₂	H	-O-	CF ₃	H	-SCH ₂ -
CH ₃ S(=O) ₂ CH ₂	H	-O-	CF ₃	H	-NHCH ₂ -
(CH ₃) ₂ NCH ₂	H	-O-	CF ₃	H	-N(Me)CH ₂ -
CH ₃ C(=O)	H	-O-	CF ₃	Me	-S-
CF ₃ C(=O)	H	-O-	CF ₃	Me	-NH-
<i>c</i> -PrC(=O)	H	-O-	CF ₃	Me	-N(Me)-
CH ₃ OC(=O)	H	-O-	CF ₃	Me	-CH ₂ -
MeNHC(=O)	H	-O-	CF ₃	Me	-C(Me) ₂ -
(Me) ₂ NC(=O)	H	-O-	CF ₃	Me	-OCH ₂ -
MeO	H	-O-	CF ₃	Me	-SCH ₂ -
EtO	H	-O-	CF ₃	Me	-NHCH ₂ -
<i>i</i> -PrO	H	-O-	CF ₃	Me	-N(Me)CH ₂ -
CF ₃ O	H	-O-	CCl ₃	H	-O-
<i>c</i> -BuO	H	-O-	CCl ₃	Me	-O-
CH ₂ =CHCH ₂ O	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-S-
CH CCH ₂ O	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-NH-
MeOCH ₂ CH ₂ O	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-N(Me)-
CH ₃ C(=O)O	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-CH ₂ -
CF ₃ C(=O)O	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-C(Me) ₂ -
MeS	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-OCH ₂ -
CF ₃ S	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-SCH ₂ -
<i>c</i> -PrS	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-NHCH ₂ -
MeNH	H	-O-	CF ₃ CH ₂	H	-N(Me)CH ₂ -
(Me) ₂ N	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-S-
ClCH ₂ CH ₂ NH	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-NH-
CH ₃ C(=O)NH	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-N(Me)-
CF ₃ C(=O)NH	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-CH ₂ -
CH ₃ S(=O) ₂ NH	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-C(Me) ₂ -
CF ₃ S(=O) ₂ NH	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-OCH ₂ -

W 為 O。

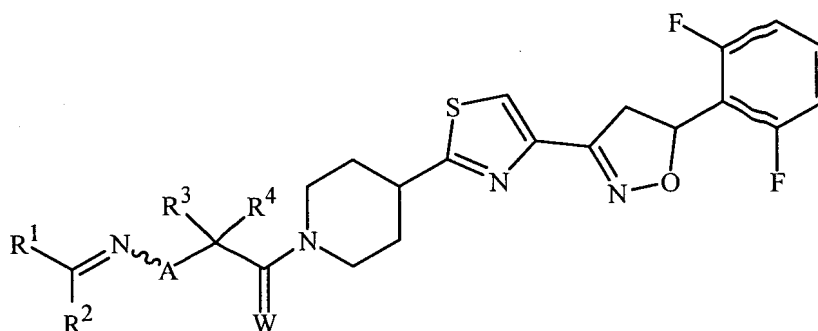
W 為 O。

R ¹	R ²	A	R ¹	R ²	A
Cl	H	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-SCH ₂ -
CF ₃	Et	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-NHCH ₂ -
CF ₃	<i>n</i> -Pr	-O-	CF ₃ CH ₂	Me	-N(Me)CH ₂ -
CF ₃	<i>i</i> -Pr	-O-	CF ₃	H	-OCH(Me)-
CF ₃	CN	-O-	CF ₃	H	-CH(CF ₃)-

W 為 S。

R ¹	R ²	A	R ¹	R ²	A
Me	Me	-O-	CF ₃	Me	-O-
CF ₃	H	-O-	CF ₃	H	-NH-

表 2

R² 為 H, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³	R ¹	R ³
CF ₃	Me	CF ₃ CH ₂	MeC(=O)
CF ₃	Et	CF ₃ CH ₂	MeOC(=O)
CF ₃	<i>n</i> -Pr	CF ₃ CH ₂	EtOC(=O)
CF ₃	<i>i</i> -Pr	CF ₃ CH ₂	MeNHC(=O)
CF ₃	<i>i</i> -Bu	CF ₃ CH ₂	(Me) ₂ NC(=O)
CF ₃	CN	CF ₃ CH ₂	Cl
CF ₃	Cl	CF ₃ CH ₂	CN
CF ₃	CH ₂ =CHCH ₂	CF ₃ CH ₂	CH ₃ S
CF ₃	CH CCH ₂	CF ₃ CH ₂	Ph
CF ₃	CF ₃	CF ₃ CH ₂	2,5-di-Cl-Ph

R² 為 H, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
CF ₃	MeOCH ₂
CF ₃	CH ₃ SCH ₂
CF ₃	CH ₃ S(=O)CH ₂
CF ₃	CH ₃ S(=O) ₂ CH ₂
CF ₃	MeC(=O)
CF ₃	EtC(=O)
CF ₃	CF ₃ C(=O)
CF ₃	MeOC(=O)
CF ₃	EtOC(=O)
CF ₃	MeNHC(=O)
CF ₃	(Me) ₂ NC(=O)
CF ₃	MeO
CF ₃	EtO
CF ₃	CF ₃ O
CF ₃	MeS
CF ₃	CF ₃ S
CF ₃	CH ₃ S(=O)
CF ₃	CH ₃ S(=O) ₂
CF ₃	CF ₃ S(=O) ₂
CF ₃	MeC(=O)O
CF ₃	CF ₃ C(=O)O
CF ₃	Ph
CF ₃	2,5-di-Cl-Ph
CF ₃	2-Cl-5-CF ₃ -Ph
CF ₃	2,5-di-Me-Ph
CF ₃	2-Me-5-CF ₃ -Ph
CF ₃	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	5-Cl-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	5-Br-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	5-Et-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	3,5-di-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-5-基
CF ₃	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪啶-2-基
CF ₃	3,5-di-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
CF ₃	3,5-di-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
CF ₃ CH ₂	Me
CF ₃ CH ₂	Et

R² 為 H, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
CF ₃ CH ₂	2-Cl-5-CF ₃ -Ph
CF ₃ CH ₂	2,5-di-Me-Ph
CF ₃ CH ₂	2-Me-5-CF ₃ -Ph
CF ₃ CH ₂	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	5-Cl-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	5-Br-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	5-Et-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	3,5-di-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-5-基
CF ₃ CH ₂	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪啶-2-基
CF ₃ CH ₂	3,5-di-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
CF ₃ CH ₂	3,5-di-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
Me	Me
Me	Et
Me	MeO
Me	EtO
Me	MeC(=O)
Me	MeOC(=O)
Me	EtOC(=O)
Me	MeNHC(=O)
Me	(Me) ₂ NC(=O)
Me	Cl
Me	CN
Me	MeS
Me	Ph
Me	2,5-di-Cl-Ph
Me	2-Cl-5-CF ₃ -Ph
Me	2,5-di-Me-Ph
Me	2-Me-5-CF ₃ -Ph
Me	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡啶-1-基
Me	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
Me	5-Cl-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
Me	5-Br-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
Me	5-Et-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
Me	3,5-di-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-1-基
Me	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡啶-5-基
Me	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪啶-2-基
Me	3,5-di-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
Me	3,5-di-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
Me	Me
Me	Et

R² 為 H, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
CF ₃ CH ₂	MeO
CF ₃ CH ₂	EtO

R² 為 H, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
Me	3,5-di-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
Me	3,5-di-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基

R² 為 Me, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
CF ₃	Me
CF ₃	Et
CF ₃	MeO
CF ₃	EtO
CF ₃	MeC(=O)
CF ₃	MeOC(=O)
CF ₃	EtOC(=O)
CF ₃	MeNHC(=O)
CF ₃	(Me) ₂ NC(=O)
CF ₃	Cl
CF ₃	CN
CF ₃	MeS
CF ₃	Ph
CF ₃	2,5-di-Cl-Ph
CF ₃	2-Cl-5-CF ₃ -Ph
CF ₃	2,5-di-Me-Ph
CF ₃	2-Me-5-CF ₃ -Ph
CF ₃	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	5-Cl-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	5-Br-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	5-Et-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	3,5-di-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-5-基
CF ₃	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪唑-2-基
CF ₃	3,5-di-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
CF ₃	3,5-di-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
Me	Me
Me	Et
Me	MeO
Me	EtO
Me	MeC(=O)
Me	MeOC(=O)

R² 為 Me, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
Me	2-Cl-5-CF ₃ -Ph
Me	2,5-di-Me-Ph
Me	2-Me-5-CF ₃ -Ph
Me	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡唑-1-基
Me	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
Me	5-Cl-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
Me	5-Br-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
Me	5-Et-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
Me	3,5-di-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
Me	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-5-基
Me	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪唑-2-基
Me	3,5-di-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
Me	3,5-di-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
CF ₃ CH ₂	Me
CF ₃ CH ₂	Et
CF ₃ CH ₂	MeO
CF ₃ CH ₂	EtO
CF ₃ CH ₂	MeC(=O)
CF ₃ CH ₂	MeOC(=O)
CF ₃ CH ₂	EtOC(=O)
CF ₃ CH ₂	MeNHC(=O)
CF ₃ CH ₂	(Me) ₂ NC(=O)
CF ₃ CH ₂	Cl
CF ₃ CH ₂	CN
CF ₃ CH ₂	MeS
CF ₃ CH ₂	Ph
CF ₃ CH ₂	2,5-di-Cl-Ph
CF ₃ CH ₂	2-Cl-5-CF ₃ -Ph
CF ₃ CH ₂	2,5-di-Me-Ph
CF ₃ CH ₂	2-Me-5-CF ₃ -Ph
CF ₃ CH ₂	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃ CH ₂	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃ CH ₂	5-Cl-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基

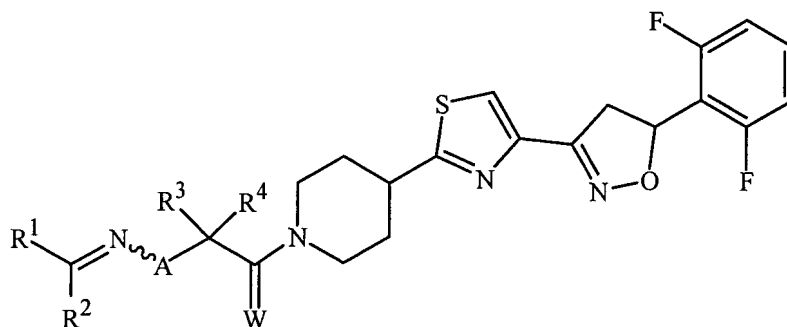
R² 為 Me, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
Me	EtOC(=O)
Me	MeNHC(=O)
Me	(Me) ₂ NC(=O)
Me	Cl
Me	CN
Me	MeS
Me	Ph
Me	2,5-di-Cl-Ph

R² 為 Me, A 為 -O-, R⁴ 為 H, 且 W 為 O。

R ¹	R ³
CF ₃ CH ₂	5-Br-3-CF ₃ -1H-吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	5-Et-3-CF ₃ -1H-吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	3,5-di-CF ₃ -1H-吡啶-1-基
CF ₃ CH ₂	1-Me-3-CF ₃ -1H-吡啶-5-基
CF ₃ CH ₂	1-Me-4-CF ₃ -1H-咪唑-2-基
CF ₃ CH ₂	3,5-di-Cl-1H-1,2,4-三唑-1-基
CF ₃ CH ₂	3,5-di-Br-1H-1,2,4-三唑-1-基

表 2A



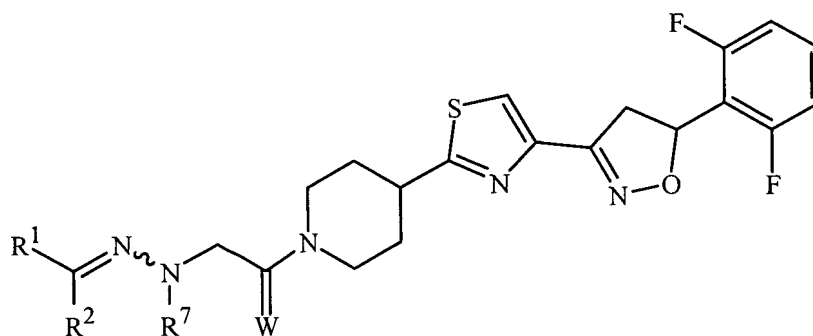
W 為 O。

R ¹	R ²	A	R ³	R ⁴
CF ₃	H	-OCH ₂ -	OH	H
CF ₃	H	-O-	Me	Me
CF ₃	H	-O-	Me	Et
CF ₃	H	-O-	H	CF ₃
CF ₃	H	-N(Et)-	H	H
CF ₃	H	-N(<i>n</i> -Pr)-	H	H
CF ₃	H	-N(<i>i</i> -Pr)-	H	H
CF ₃	H	-N(<i>n</i> -Bu)-	H	H
CF ₃	H	-N(CN)-	H	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₂ Cl)-	H	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ OCH ₃)-	H	H
CF ₃	H	-N(SCH ₂ OCH ₃)-	H	H
CF ₃	H	-N(C(=O)Me)-	H	H
CF ₃	H	-N(C(=O)CF ₃)-	H	H

W 為 O。

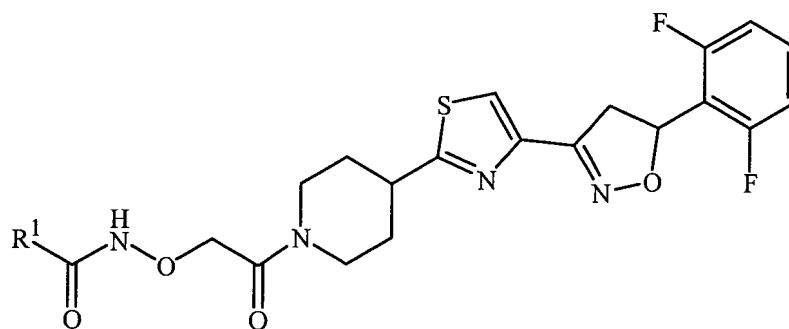
R ¹	R ²	A	R ³	R ⁴
CF ₃	H	-N(C(=O)OMe)-	H	H
CF ₃	H	-N(C(=O)NHMe)-	H	H
CF ₃	H	-N(C(=O)NMe ₂)-	H	H
CF ₃	H	-N(S(=O) ₂ Me)-	H	H
CF ₃	H	-N(S(=O) ₂ CF ₃)-	H	H
CF ₃	Me	-N(Et)-	H	H
CF ₃	Me	-N(<i>n</i> -Pr)-	H	H
CF ₃	Me	-N(<i>i</i> -Pr)-	H	H
CF ₃	Me	-N(<i>n</i> -Bu)-	H	H
CF ₃	Me	-N(CN)-	H	H
Me	Me	-N(Et)-	H	H
Me	Me	-N(<i>n</i> -Pr)-	H	H
Me	Me	-N(<i>i</i> -Pr)-	H	H
Me	Me	-N(<i>n</i> -Bu)-	H	H
Me	Me	-N(CN)-	H	H
Me	H	-N(Et)-	H	H
Me	H	-N(<i>n</i> -Pr)-	H	H
Me	H	-N(<i>i</i> -Pr)-	H	H
Me	H	-N(<i>n</i> -Bu)-	H	H
Me	H	-N(CN)-	H	H
CF ₃ CH ₂	H	-N(Et)-	H	H
CF ₃ CH ₂	H	N(<i>n</i> -Pr)-	H	H
CF ₃ CH ₂	H	-N(<i>i</i> -Pr)-	H	H
CF ₃ CH ₂	H	-N(<i>n</i> -Bu)-	H	H
CF ₃ CH ₂	H	-N(CN)-	H	H

表 3



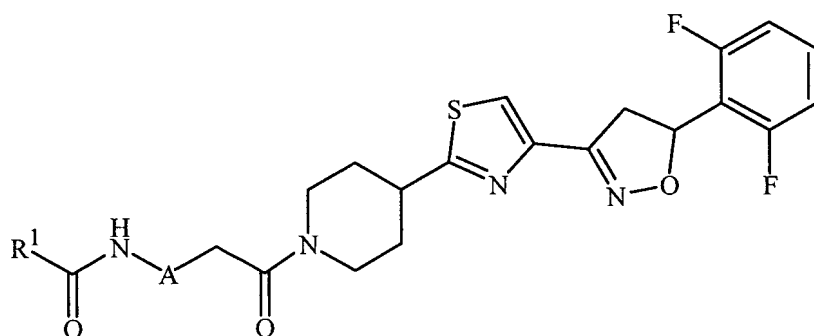
W 為 O。			W 為 O。			W 為 O。		
R ¹	R ²	R ⁷	R ¹	R ²	R ⁷	R ¹	R ²	R ⁷
CF ₃	-CH ₂ CH ₂ -		CF ₃	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -		Me	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
CF ₃	-CH ₂ CH(Me)-		CF ₃	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-		Me	-CH ₂ (CH ₂) ₂ CH ₂ -	
CF ₃	-CH ₂ C(Me) ₂ -		CF ₃	-OC(=O)-H ₂ -		Me	-CH(CHCF ₃)-	
CF ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		Me	-CH ₂ CH(Me)-		Me	-CH ₂ CH ₂ CH(Me)-	
Me	-CH ₂ CH ₂ -		Me	-CH ₂ C(Me) ₂ -		Me	-CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)-	
Me	-OC(Me) ₂ -							

表 4



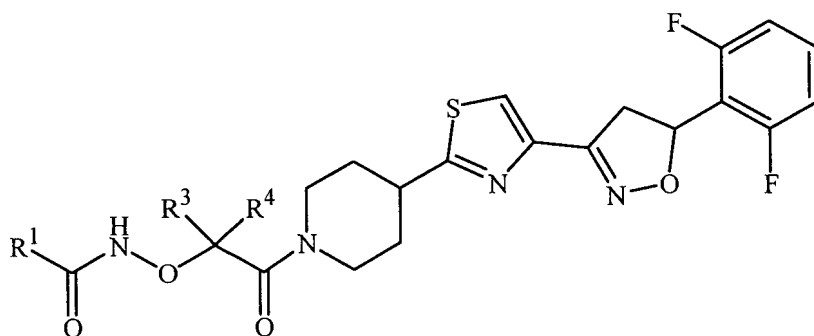
R ¹	R ¹	R ¹	R ¹
Me	CH ₂ =CHCH ₂	(Me) ₂ NCH ₂	MeOCH ₂ CH ₂ O
Et	CH CCH ₂	MeC(=O)	<i>c</i> -戊基
<i>n</i> -Pr	CF ₃	CF ₃ C(=O)	CH ₃ C(=O)O
<i>i</i> -Pr	CF ₃ CH ₂	<i>c</i> -PrC(=O)	CF ₃ C(=O)O
<i>n</i> -Bu	ClCH ₂ CH ₂	MeOC(=O)	MeS
<i>i</i> -Bu	<i>c</i> -Pr	MeNHC(=O)	CF ₃ S
<i>t</i> -Bu	<i>c</i> -己基	(Me) ₂ NC(=O)	<i>c</i> -PrS
己基	1-F- <i>c</i> -Pr	MeO	MeNH
H	CF ₂ =CF	EtO	(Me) ₂ N
CN	<i>c</i> -PrCH ₂	<i>i</i> -PrO	ClCH ₂ CH ₂ NH
NH ₂	MeOCH ₂	CF ₃ O	CH ₃ C(=O)ONH
HC(=O)	MeSCH ₂	<i>c</i> -BuO	CF ₃ C(=O)ONH
HOC(=O)	CH ₃ S(=O)CH ₂	CH ₂ =CHCH ₂ O	MeS(=O) ₂ NH
CH ₂ =CH	CH ₃ S(=O) ₂ CH ₂	CH CCH ₂ O	CF ₃ S(=O) ₂ NH

表 5



R ¹	A	R ¹	A	R ¹	A	R ¹	A
CF ₃	-S-	CF ₃	-OCH ₂ -	Me	-NH-	Me	-N(CN)-
CF ₃	-NH-	CF ₃	-SCH ₂ -	Me	-NMe-	Me	-SCH ₂ -
CF ₃	N(Me)-	CF ₃	-NHCH ₂ -	Me	-CH ₂ -	Me	-NHCH ₂ -
CF ₃	-CH ₂ -	CF ₃	-N(Me)CH ₂ -	Me	-C(Me) ₂ -	Me	-N(Me)CH ₂ -
CF ₃	-C(Me) ₂ -	Me	-S-	Me	-OCH ₂ -	CF ₃	-OCH(Me)-
CF ₃	-O-	CF ₃	-N(CH ₂ CH ₂ Cl)-	CF ₃	-N(S(=O) ₂ Me)-	CF ₃	-CH(CF ₃)-
CF ₃	-N(Et)-	CF ₃	-N(CH ₂ OMe)-	CF ₃	-N(S(=O) ₂ CF ₃)-		
CF ₃	-N(<i>n</i> -Pr)-	CF ₃	-N(SCH ₂ OMe)-	Me	-N(Et)-		
CF ₃	-N(<i>i</i> -Pr)-	CF ₃	-N(C(=O)Me)-	Me	-N(<i>n</i> -Pr)-		
CF ₃	-N(<i>n</i> -Bu)-	CF ₃	-N(C(=O)OMe)-	Me	-N(<i>n</i> -Bu)-		
CF ₃	-N(CN)-	CF ₃	-N(C(=O)NHMe)-				

表 6

R⁴ 為 H。R⁴ 為 H。R⁴ 為 H。

R ¹	R ³	R ¹	R ³	R ¹	R ³
CF ₃	Me	CF ₃	MeS	Me	EtO
CF ₃	Et	CF ₃	CF ₃ S	Me	MeC(=O)
CF ₃	<i>n</i> -Pr	CF ₃	MeS(=O)	Me	MeOC(=O)
CF ₃	<i>i</i> -Pr	CF ₃	MeS(=O) ₂	Me	EtOC(=O)
CF ₃	<i>i</i> -Bu	CF ₃	CF ₃ S(=O) ₂	Me	MeNHC(=O)
CF ₃	CN	CF ₃	MeC(=O)O	Me	Me ₂ NC(=O)
CF ₃	Cl	CF ₃	Ph	Me	Cl
CF ₃	CH ₂ =CHCH ₂	CF ₃	2,5-di-Cl-Ph	Me	CN
CF ₃	CH CCH ₂	CF ₃	2-Cl-5-CF ₃ -Ph	Me	MeS
CF ₃	CF ₃	CF ₃	2,5-di-Me-Ph	Me	Ph
CF ₃	MeOCH ₂	CF ₃	2-Me-5-CF ₃ -Ph	Me	2,5-di-Cl-Ph
CF ₃	CH ₃ SCH ₂	CF ₃	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡唑-1-基	Me	2-Cl-5-CF ₃ -Ph
CF ₃	MeS(=O)CH ₂	CF ₃	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基	Me	2,5-di-Me-Ph
CF ₃	MeS(=O) ₂ CH ₂	CF ₃	5-Cl-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基	Me	2-Me-5-CF ₃ -Ph
CF ₃	MeC(=O)	CF ₃	5-Br-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基	Me	3,5-di-Me-1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	EtC(=O)	CF ₃	5-Et-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基	Me	5-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	CF ₃ C(=O)	CF ₃	3,5-di-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基	Me	5-Cl-3-(CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	MeOC(=O)	CF ₃	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-5-基	Me	5-Br-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	EtOC(=O)	CF ₃	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪唑-2-基	Me	5-Et-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	MeNHC(=O)	CF ₃	3,5-di-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基	Me	3,5-di-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-1-基
CF ₃	Me ₂ NC(=O)	CF ₃	3,5-di-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基	Me	1-Me-3-CF ₃ -1 <i>H</i> -吡唑-5-基
CF ₃	MeO	Me	Me	Me	1-Me-4-CF ₃ -1 <i>H</i> -咪唑-2-基
CF ₃	EtO	Me	Et	Me	3,5-di-Cl-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基
CF ₃	CF ₃ O	Me	MeO	Me	3,5-di-Br-1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基

R⁴ 為 Me。

R ¹	R ³
CF ₃	Me

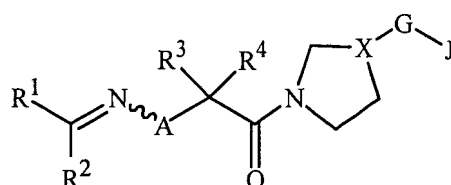
R⁴ 為 Et。

R ¹	R ³
CF ₃	Me

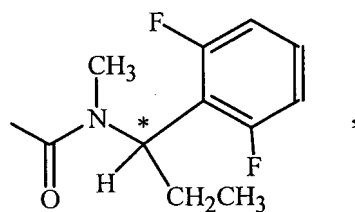
R⁴ 為 CF₃。

R ¹	R ³
CF ₃	H

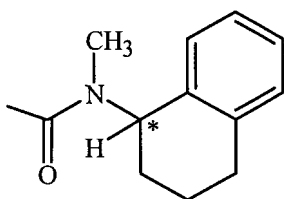
表 7



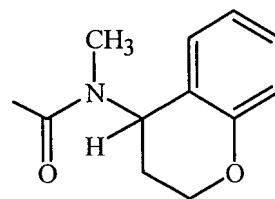
在表 8 中，結構 G-1 和 G-2 在上面實施例中的「示例 2」中示出。示例 2 中連接至 G 的取代基 R^{26a} 為 H。結構 J (如 J-29-1) 在上面實施例中的「示例 A」中示出，不同之處在於當 J 為 J-83-1 至 J-93-1 其中之一時，則 J 的結構在下面示出。在結構 J-83-1 至 J-93-1 中，用星號(*)標定的碳原子含有立構中心。



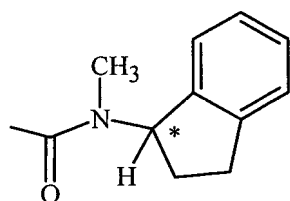
J-83-1



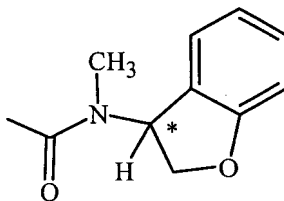
J-84-1



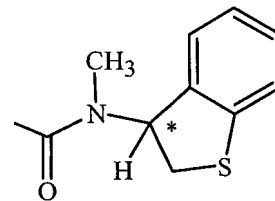
J-85-1



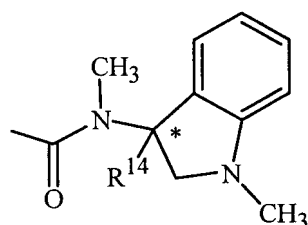
J-86-1



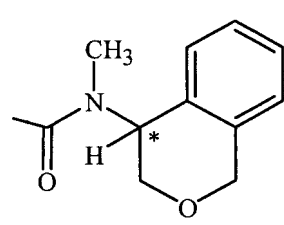
J-87-1



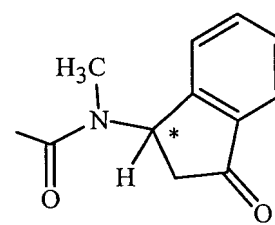
J-88-1



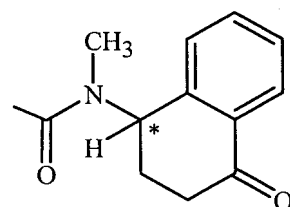
J-89-1



J-90-1



J-92-1



J-93-1

R¹ 為 Me, R² 為 H, A 為 -O-, R³ 為 H, R⁴ 為 H, X 為 X¹, 且 G 為 G-1。

J	J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51	J-83-1
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52	J-84-1
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53	J-85-1

R^1 為 Me, R^2 為 H, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。

J	J	J	J	J	J	J
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54	J-88-1
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55	J-89-1
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-58	J-90-1
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-59	J-92-1
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-60	J-93-1
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-86-1	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-87-1	

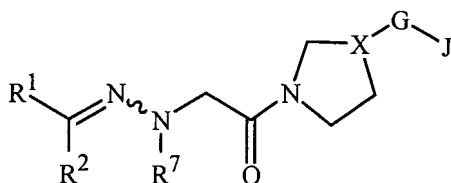
本揭露亦包括表 7A-1 至 7A-77, 各表係如同表 7 建構, 除了表 7 的行頭 (即「 R^1 為 Me, R^2 為 H, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。」) 分別用下列所示行頭代替。例如, 表 7A-1 的行頭為「 R^1 為 Me, R^2 為 H, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。」), 而 J 如同上表 7 所定義。

表	行頭
7A-1	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-2	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-3	R^1 為 Et, R^2 為 H, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-4	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-5	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-6	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-7	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-8	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-9	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 H, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-10	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-11	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-12	R^1 為 Me, R^2 為 H, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-13	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-14	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-15	R^1 為 Et, R^2 為 H, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-16	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-17	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-18	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-19	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-20	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。

表	行頭
7A-21	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 H, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-22	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-23	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-24	R^1 為 Me, R^2 為 H, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-25	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-26	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-27	R^1 為 Et, R^2 為 H, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-28	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-29	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-30	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-31	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-32	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-33	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 H, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-34	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-35	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-36	R^1 為 Me, R^2 為 H, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-37	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-38	R^1 為 Me, R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-39	R^1 為 Et, R^2 為 H, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-40	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-41	R^1 為 Et, R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-42	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-43	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-44	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 Me, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-45	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 H, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-46	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-47	R^1 為 CF_3CH_2 , R^2 為 Me, A 為 -N(Et)-, R^3 為 Me, R^4 為 H, X 為 X^1 , 且 G 為 G-1。
7A-48	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^2 , 且 G 為 G-1。
7A-49	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -O-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^2 , 且 G 為 G-1。
7A-50	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^2 , 且 G 為 G-1。
7A-51	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -NH-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^2 , 且 G 為 G-1。
7A-52	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^2 , 且 G 為 G-1。
7A-53	R^1 為 CF_3 , R^2 為 Me, A 為 -N(Me)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^2 , 且 G 為 G-1。
7A-54	R^1 為 CF_3 , R^2 為 H, A 為 -N(Et)-, R^3 為 H, R^4 為 H, X 為 X^2 , 且 G 為 G-1。

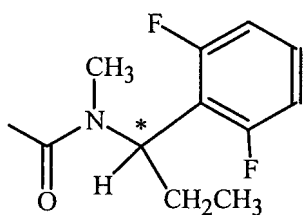
表	行頭
7A-55	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -N(Et)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-1。
7A-56	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -O-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
7A-57	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -O-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
7A-58	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -NH-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
7A-59	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -NH-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
7A-60	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -N(Me)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
7A-61	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -N(Me)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
7A-62	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -N(Et)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
7A-63	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -N(Et)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
7A-64	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -O-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-65	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -O-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-66	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -NH-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-67	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -NH-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-68	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -N(Me)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-69	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -N(Me)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-70	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 H, A 為 -N(Et)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-71	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 Me, A 為 -N(Et)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
7A-72	R ¹ 為 Me, R ² 為 OH, A 為 -O-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
7A-73	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 OH, A 為 -O-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
7A-74	R ¹ 為 Me, R ² 為 OH, A 為 -NH-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
7A-75	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 OH, A 為 -NH-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
7A-76	R ¹ 為 Me, R ² 為 OH, A 為 -N(Me)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
7A-77	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 為 OH, A 為 -N(Me)-, R ³ 為 H, R ⁴ 為 H, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。

表 8

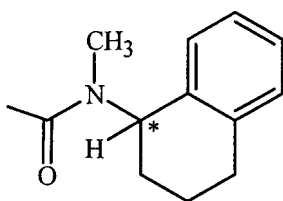


在表 8 中，結構 G-1 和 G-2 在上面實施例中的示例 2 中示出。示例 2 中所示連接至 G 的取代基 R^{26a} 為 H。結構 J (如 J-29-1) 在上面實施例中的「示例 A」中示出，不同之處在於當 J 為 J-83-1 至 J-93-1 其中之一時，

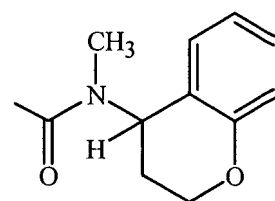
則 J 的結構在下面示出。在結構 J-83-1 至 J-93-1 中，用星號(*)標定的碳原子含有立構中心。



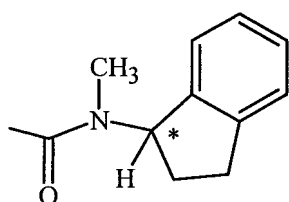
J-83-1



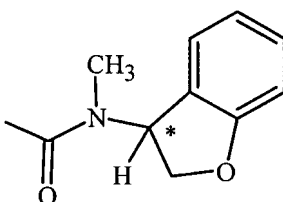
J-84-1



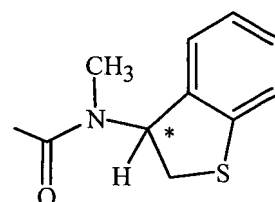
J-85-1



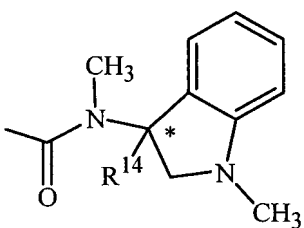
J-86-1



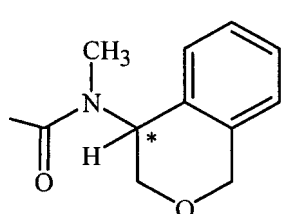
J-87-1



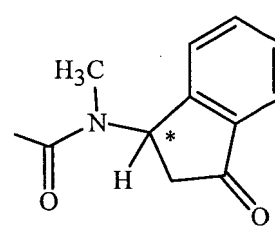
J-88-1



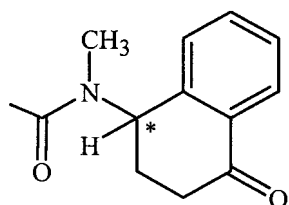
J-89-1



J-90-1



J-92-1



J-93-1

R^1 為 Me, R^2 與 R^{47} 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$, X 為 X^1 且 G 為 G-1**。

J	J	J	J	J	J	J
---	---	---	---	---	---	---

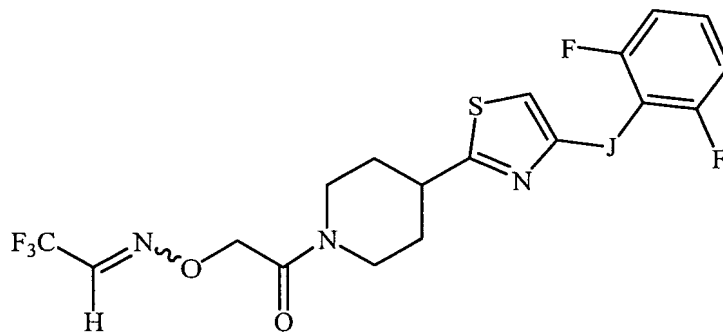
J	J	J	J	J	J	J
J-29-1	J-29-11	J-29-21	J-29-31	J-29-41	J-29-51	J-85-1
J-29-2	J-29-12	J-29-22	J-29-32	J-29-42	J-29-52	J-86-1
J-29-3	J-29-13	J-29-23	J-29-33	J-29-43	J-29-53	J-87-1
J-29-4	J-29-14	J-29-24	J-29-34	J-29-44	J-29-54	J-88-1
J-29-5	J-29-15	J-29-25	J-29-35	J-29-45	J-29-55	J-89-1
J-29-6	J-29-16	J-29-26	J-29-36	J-29-46	J-29-58	J-90-1
J-29-7	J-29-17	J-29-27	J-29-37	J-29-47	J-29-59	J-92-1
J-29-8	J-29-18	J-29-28	J-29-38	J-29-48	J-29-60	J-93-1
J-29-9	J-29-19	J-29-29	J-29-39	J-29-49	J-83-1	
J-29-10	J-29-20	J-29-30	J-29-40	J-29-50	J-84-1	

本揭露亦包括表 8A-1 至 8A-22，各表係如同表 8 建構，除了表 8 的行頭（即「 R^1 為 Me， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-1。」）分別用下列所示行頭代替。例如，表 8A-1 的行頭為「 R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-1。」，而 J 如同上表 8 所定義。

表	行頭
8A-1	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-1。
8A-2	R^1 為 Me， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-1。
8A-3	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-1。
8A-4	R^1 為 Me， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-1。
8A-5	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-1。
8A-6	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^2 ，且 G 為 G-1。
8A-7	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$ ，X 為 X^2 ，且 G 為 G-1。
8A-8	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^2 ，且 G 為 G-1。
8A-9	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-2。
8A-10	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-2。
8A-11	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^1 ，且 G 為 G-2。
8A-12	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^2 ，且 G 為 G-2。
8A-13	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Me})-$ ，X 為 X^2 ，且 G 為 G-2。
8A-14	R^1 為 CF_3 ， R^2 與 R^7 一起形成 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ ，X 為 X^2 ，且 G 為 G-2。

表	行頭
8A-15	R ¹ 為 Me, R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
8A-16	R ¹ 為 Me, R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
8A-17	R ¹ 為 Me, R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ² , 且 G 為 G-1。
8A-18	R ¹ 為 Me, R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。
8A-19	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-1。
8A-20	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ¹ , 且 G 為 G-2。
8A-21	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ² , 且 G 為 G-1。
8A-22	R ¹ 為 CF ₃ , R ² 與 R ⁷ 一起形成 -CH ₂ CH(CF ₃)-, X 為 X ² , 且 G 為 G-2。

表 9

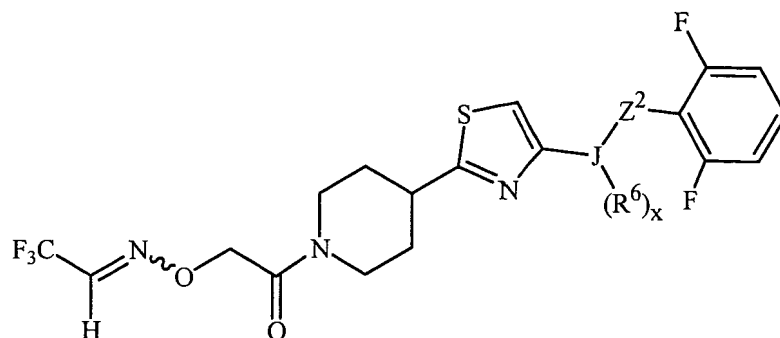


在表 9 中，結構 J (如 J1) 在上面實施例中的示例 3 中示出，其中 x 為 1 且 R⁶ 2,6-二氟苯基如上結構所示。J 後面括號中的數字指 J (噻唑) 環和如上結構 2,6-二氟苯基的連接點。第一個數字為 J 上噻唑環連接的環位置，第二個數字為 J 上與 2,6-二氟苯基環連接的環位置。

J	J	J	J	J	J	J
J-1 (2/4)	J-6 (3/1)	J-21 (3/6)	J-27 (5/3)	J-33 (4/2)	J-45 (2/4)	J-73 (4/2)
J-1 (2/5)	J-7 (5/3)	J-21 (5/3)	J-28 (3/5)	J-34 (1/3)	J-45 (2/5)	J-73 (1/3)
J-1 (4/2)	J-7 (3/5)	J-22 (2/4)	J-28 (5/3)	J-34 (1/4)	J-45 (2/6)	J-73 (1/4)
J-1 (5/2)	J-8 (5/3)	J-22 (2/5)	J-29 (3/5)	J-34 (3/5)	J-46 (2/4)	J-73 (4/1)
J-2 (2/4)	J-8 (3/5)	J-22 (4/6)	J-29 (5/3)	J-34 (3/1)	J-46 (2/5)	J-74 (3/5)

J	J	J	J	J	J	J
J-2 (2/5)	J-9 (4/1)	J-22 (4/2)	J-30 (3/5)	J-34 (4/1)	J-46 (4/2)	J-74 (5/3)
J-2 (4/2)	J-10 (3/5)	J-22 (5/2)	J-30 (5/3)	J-35 (4/1)	J-46 (5/2)	J-75 (3/5)
J-2 (5/2)	J-10 (5/3)	J-23 (2/5)	J-30 (3/1)	J-36 (1/3)	J-47 (2/4)	J-75 (5/3)
J-3 (4/1)	J-11 (3/5)	J-23 (2/6)	J-30 (4/1)	J-36 (3/1)	J-47 (2/5)	J-75 (2/4)
J-4 (2/4)	J-11 (5/3)	J-24 (2/4)	J-31 (2/4)	J-36 (3/5)	J-47 (4/2)	J-75 (2/5)
J-4 (2/5)	J-12 (3/1)	J-24 (2/5)	J-31 (2/5)	J-36 (5/3)	J-47 (5/2)	J-76 (3/6)
J-4 (4/2)	J-13 (1/4)	J-24 (4/2)	J-31 (3/5)	J-37 (2/5)	J-48 (3/5)	J-76 (6/3)
J-4 (5/2)	J-13 (4/1)	J-24 (5/2)	J-31 (3/1)	J-37 (5/2)	J-49 (2/4)	J-77 (3/5)
J-4 (3/5)	J-14 (5/3)	J-25 (2/4)	J-31 (4/1)	J-37 (2/4)	J-49 (2/5)	J-77 (5/3)
J-4 (5/3)	J-15 (2/5)	J-25 (2/5)	J-31 (4/2)	J-37 (4/2)	J-49 (4/2)	J-78 (1/3)
J-5 (2/5)	J-16 (2/5)	J-25 (4/2)	J-31 (5/2)	J-38 (2/5)	J-49 (5/2)	J-79 (1/3)
J-5 (4/2)	J-17 (4/2)	J-25 (5/2)	J-32 (2/4)	J-38 (5/2)	J-50 (2/6)	J-79 (3/1)
J-5 (5/2)	J-18 (5/2)	J-26 (2/4)	J-32 (2/5)	J-38 (2/4)	J-51 (2/6)	J-80 (1/3)
J-5 (3/5)	J-19 (2/4)	J-26 (2/5)	J-32 (3/5)	J-38 (4/2)	J-52 (2/6)	J-80 (3/1)
J-5 (5/3)	J-19 (4/2)	J-26 (4/2)	J-32 (5/3)	J-40 (3/5)	J-69 (1/3)	J-81 (3/5)
J-6 (2/4)	J-20 (2/4)	J-26 (5/2)	J-32 (5/2)	J-40 (5/3)	J-69 (1/4)	J-81 (5/3)
J-6 (3/5)	J-20 (2/5)	J-26 (4/1)	J-32 (4/2)	J-41 (1/3)	J-70 (1/3)	J-82 (3/5)
J-6 (2/5)	J-20 (2/6)	J-27 (2/4)	J-33 (2/4)	J-41 (1/4)	J-71 (2/4)	J-82 (3/6)
J-6 (4/2)	J-20 (3/5)	J-27 (2/5)	J-33 (2/5)	J-44 (1/3)	J-71 (4/2)	J-82 (5/3)
J-6 (5/2)	J-20 (4/2)	J-27 (3/5)	J-33 (3/5)	J-44 (2/4)	J-72 (2/4)	J-82 (6/3)
J-6 (4/2)	J-20 (5/2)	J-27 (4/2)	J-33 (5/3)	J-44 (2/5)	J-72 (4/2)	
J-6 (5/3)	J-21 (3/5)	J-27 (5/2)	J-33 (5/2)	J-44 (2/6)	J-73 (2/4)	

表 10

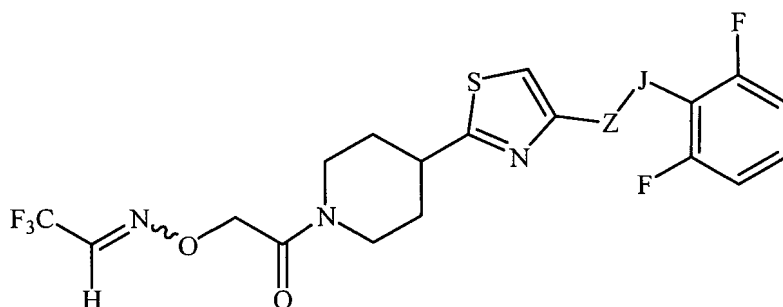


在表 10 中，J (如 J-3) 的結構在上面實施例中的示例 3 中示出。J 後面括號中的其他數字指 J 至噻唑環和如上結構 Z² 的連接點。第一個數字為 J 上噻唑環連接的環位置，第二個數字為 J 上與 Z² 連接的環位置。下列(R⁶)_x 列指出不是上述結構中 -Z²-2,6-二氟苯取代基的 R⁶ 取代基。

Z² 列中的短劃線「-」指示一直接鍵。

J	(R ⁶) _x	Z ²	J	(R ⁶) _x	Z ²	J	(R ⁶) _x	Z ²
J-3 (2/4)	1-Me	-	J-74 (2/4)	3-CH ₃	-	J-69 (1/3)	4-CF ₃ O	-
J-3 (2/5)	1-Me	-	J-74 (2/5)	3-CH ₃	-	J-69 (1/3)	4-MeS	-
J-3 (4/2)	1-Me	-	J-74 (4/2)	3-CH ₃	-	J-69 (1/3)	4-MeS(=O)	-
J-3 (5/2)	1-Me	-	J-74 (5/2)	3-CH ₃	-	J-69 (1/3)	4-MeS(=O) ₂	-
J-9 (5/3)	1-Me	-	J-75 (3/5)	2-CH ₃	-	J-69 (1/3)	4-CF ₃ S	-
J-9 (3/5)	1-Me	-	J-75 (5/3)	2-CH ₃	-	J-69 (1/3)	4-CHF ₂ OCH ₂	-
J-12 (3/5)	1-Me	-	J-69 (1/3)	4-F	-	J-69 (1/3)	4-CH ₂ OH	-
J-12 (5/3)	1-Me	-	J-69 (1/3)	4-Cl	-	J-74 (2/5)	3-CH ₃ C(=O)	-
J-14 (3/5)	1-Me	-	J-69 (1/3)	4-OH	-	J-69 (1/3)	4-CH ₃ C(=O)O	-
J-39 (3/5)	4-Me	-	J-69 (1/3)	4-NH ₂	-	J-69 (1/3)	4-CH ₃ C(=O)S	-
J-39 (5/3)	4-Me	-	J-69 (1/3)	4-OEt	-	J-69 (1/3)	4-MeNHC(=O)	-
J-69 (1/3)	4-CN	O	J-69 (1/3)	4-NO ₂	NH	J-69 (1/3)	4-CF ₃	S
J-69 (1/3)	H	O	J-69 (1/3)	H	S	J-69 (1/3)	H	S(=O)
J-69 (1/3)	H	NH	J-69 (1/3)	H	NMe	J-69 (1/3)	H	S(=O) ₂
J-69 (1/3)	H	CH ₂						

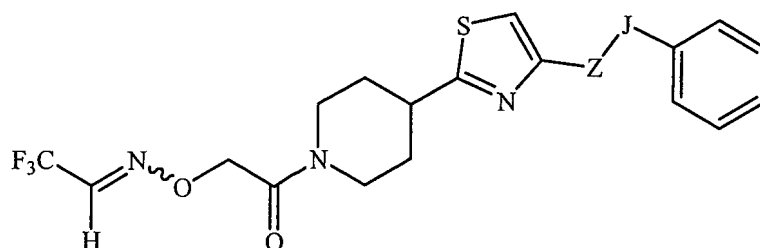
表 11



在表 11 中，J (如 J-3) 的結構在上面實施例中的示例 3 中示出，其中 x 為 1 且 R⁶ 為如上結構所述的 2,6-二氟苯基。J 後面括號中的數字指在上述結構中 J 至 Z 和 2,6-二氟苯基環的連接點。第一個數字為 J 上與 Z 連接的環位置，第二個數字為 J 上與 2,6-二氟苯基環連接的環位置。

Z	J	Z	J	Z	J
CH ₂	J-3 (1/4)	CH ₂	J-18 (2/5)	CH ₂	J-31 (1/4)
CH ₂	J-6 (1/3)	CH ₂	J-26 (1/4)	CH ₂	J-35 (1/4)
CH ₂	J-9 (1/4)	CH ₂	J-30 (1/3)	CH ₂	J-36 (1/3)
CH ₂	J-12 (1/3)	CH ₂	J-30 (1/4)	CH ₂	J-42 (1/3)
CH ₂	J-17 (2/4)	CH ₂	J-31 (1/3)	CH ₂	J-42 (1/4)

表 12

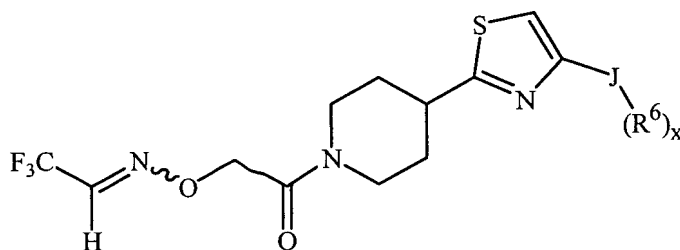


在表 12 中，J (如 J-29) 的結構在上面實施例中的「示例 3」中示出，其中 x 為 1 且 R⁶ 為如上結構所述的苯基。J 後面括號中的數字指上述結構中 J 至 Z 和苯

環的連接點。第一個數字為 J 上與 Z 連接的環位置，第二個數字為 J 上與苯環連接的環位置。

Z	J	Z	J	Z	J
O	J-29 (3/5)	S(=O) ₂	J-29 (3/5)	N(<i>n</i> -Pr)	J-29 (3/5)
S	J-29 (3/5)	NH	J-29 (3/5)	CH ₂	J-29 (3/5)
S(=O)	J-29 (3/5)	N(Me)	J-29 (3/5)	CH(<i>i</i> -Bu)	J-29 (3/5)

表 13



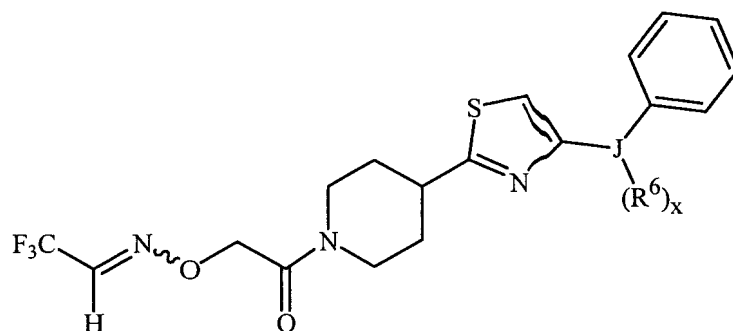
在表 13 中，J (如 J-53) 的結構在上面實施例中的示例 3 中示出。下列(R⁶)_x 列指出連接至 J 環的 R⁶ 取代基。當 R⁶ 為氫時，此即等同於 J 為未取代 (即 x 為 0)。J 後面括號中的數字指 J 環至上述結構中的噻唑環的連接點。

J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x
J-53 (2)	H	J-29 (3)	5-(4-Me-3-戊烯-1-基)	J-69 (1)	3- <i>c</i> -Pr
J-54 (2)	H	J-29 (3)	5-(3,3-di-Me-1-丁炔-1 基)	J-69 (1)	3- <i>c</i> -Bu
J-55 (2)	H	J-29 (3)	5-(4-Me- <i>c</i> -己基)	J-69 (1)	3- <i>c</i> -戊基
J-56 (2)	H	J-29 (3)	5-CF ₂ CF ₃	J-69 (1)	3- <i>c</i> -己基

J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x
J-57 (2)	1-Me	J-29 (3)	5-(3,3-di-Cl-2-丙烯-1-基)	J-69 (1)	3-CF ₃ O
J-58 (3)	1-Me	J-29 (3)	5-Me ₃ Si	J-69 (1)	3- <i>i</i> -PrO
J-59 (2)	H	J-69 (1)	4-CF ₃ CH ₂ S(=O) ₂	J-69 (1)	3- <i>i</i> -BuO
J-60 (2)	H	J-22 (2)	4- <i>i</i> -BuNH	J-69 (1)	3-Cl
J-61 (2)	H	J-22 (2)	4-(Et) ₂ N	J-69 (1)	3-Br
J-62 (2)	H	J-22 (2)	4- <i>c</i> -hexyl-NH	J-69 (1)	4-I
J-63 (3)	H	J-69 (1)	4- <i>i</i> -PrOCH ₂	J-69 (1)	4-Me
J-64 (2)	H	J-69 (1)	4- <i>i</i> -PrC(=O) ₂	J-69 (1)	4-Et
J-65 (3)	H	J-29 (3)	5-CH ₃ C(=O)N H	J-69 (1)	4- <i>n</i> -Pr
J-66 (6)	H	J-29 (3)	5-(MeC(=O) ₂ N	J-69 (1)	4- <i>i</i> -Pr
J-53 (2)	H	J-29 (3)	5-PhC(=O)(Me) N	J-69 (1)	4- <i>n</i> -Bu
J-53 (2)	H	J-29 (3)	5-CH ₃ C(=O)(Et) N	J-69 (1)	4- <i>t</i> -Bu
J-67 (2)	H	J-29 (3)	5-PhC(=O)(Et) N	J-69 (1)	4-CH ₃ (CH ₂) ₄
J-68 (2)	H	J-29 (3)	5-MeOC(=O)N H	J-69 (1)	4-(Me) ₂ CH(CH ₂) ₂
J-53 (2)	H	J-29 (3)	5-EtOC(=O)NH	J-69 (1)	4-(Me) ₂ C(Et)
J-53 (2)	H	J-29 (3)	5-EtOC(=O)(M e)N	J-69 (1)	4- <i>c</i> -Pr
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3-Cl	J-69 (1)	4- <i>c</i> -Bu
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3-Br	J-69 (1)	4- <i>c</i> -戊基
J-68 (2)	H	J-69 (1)	3-I	J-69 (1)	4- <i>c</i> -己基
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3-Me	J-69 (1)	4-CF ₃ O
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3-Et	J-69 (1)	4- <i>i</i> -PrO
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3- <i>n</i> -Pr	J-69 (1)	4- <i>i</i> -BuO
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3- <i>i</i> -Pr	J-69 (1)	3,4-di-Cl
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3-Bu	J-69 (1)	3,4-di-Br

J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3- <i>i</i> -Bu	J-69 (1)	3,4-di-Me
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3- <i>s</i> -Bu	J-69 (1)	3,4-di-Et
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3- <i>t</i> -Bu	J-69 (1)	3,4-di-MeO
J-53 (2)	H	J-69 (1)	3-CH ₃ (CH ₂) ₄	J-69 (1)	3,4-di-EtO
J-69 (1)	4- <i>t</i> -BuS(=O) ₂	J-69 (1)	3-(Me) ₂ CH(CH ₂) ₂	J-4 (2)	5- <i>i</i> -Bu
J-69 (1)	4-Et ₂ NC(=O)	J-69 (1)	3-(Me) ₂ C(Et)	J-5 (2)	5- <i>i</i> -Bu

表 14

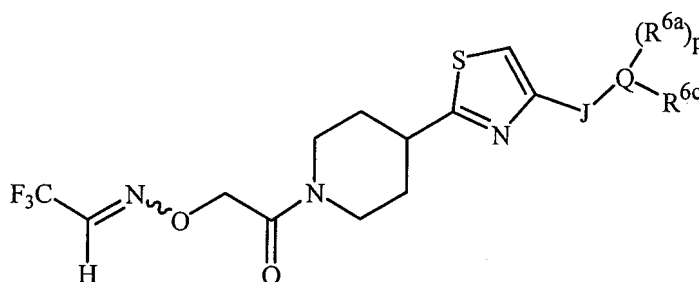


在表 14 中，J (如 J-29) 的結構在上面實施例中的示例 3 中示出。J 後面括號中的數字指上述結構中 J 與噻唑環和 2,6-二氟苯基的連接點。第一個數字為 J 上與噻唑環連接的環位置，第二個數字為 J 上與 2,6-二氟苯基連接的環位置。下列(R⁶)_x 列指出連接至 J 環且非上述結構中的苯基的 R⁶ 取代基。

J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x
---	--------------------------------	---	--------------------------------	---	--------------------------------

J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x	J	(R ⁶) _x
J-29 (3/5)	4-Me	J-29 (3/5)	4,4-di-Me	J-29 (3/5)	5-CF ₃
J-29 (3/5)	5-Me	J-29 (3/5)	5-Et	J-29 (3/5)	5-MeO
J-29 (3/5)	4,5-di-Me	J-29 (3/5)	5-c-Pr	J-26 (2/5)	1-Me

表 15

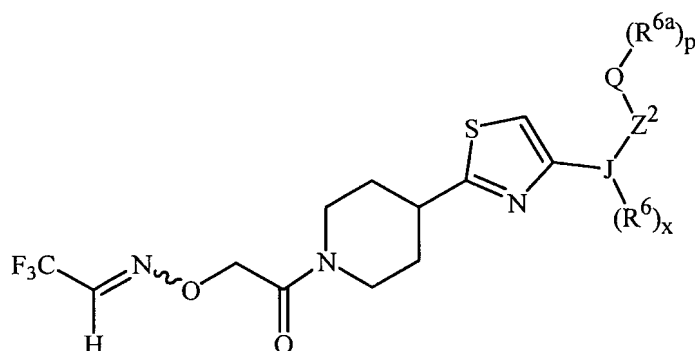


在表 15 中，J (如 J-29) 的結構在上面實施例中的示例 3 中示出其中 x 為 1、R⁶ 為 -Z²Q 且 Z² 為直接鍵。J 後面括號中的數字指 J 環與噻唑環和 Q 的連接點。第一個數字為 J 上與噻唑環連接的環位置，第二個數字為 J 上與 Q 連接的環位置。Q 的結構 (如 Q-3) 在上面實施例中的示例 5 中示出其中 g 為 0。下列 (R^{6a})_p 與 R^{6c} 列指出連接至 Q 的取代基。下列 (R^{6a})_p 列中的折號「-」指出未有 R^{6a} 取代基存在。

J	Q	(R ^{6a}) _p	R ^{6c}	J	Q	(R ^{6a}) _p	R ^{6c}
J-29 (3/5)	Q-3	-	Me	J-29 (3/5)	Q-88	-	Me
J-29 (3/5)	Q-10	-	Me	J-29 (3/5)	Q-92	-	Me
J-29 (3/5)	Q-11	-	Me	J-29 (3/5)	Q-95	-	Me
J-29 (3/5)	Q-12	-	Me	J-29 (3/5)	Q-102	-	Me
J-29 (3/5)	Q-13	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	-	MeC(=O)
J-29 (3/5)	Q-14	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	-	MeOC(=O)
J-29 (3/5)	Q-21	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	-	MeO
J-29 (3/5)	Q-22	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	5-Cl	Me
J-29 (3/5)	Q-23	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	5-Me	Me

J	Q	(R ^{6a}) _p	R ^{6c}	J	Q	(R ^{6a}) _p	R ^{6c}
J-29 (3/5)	Q-28	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	5-NO ₂	Me
J-29 (3/5)	Q-31	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	5-NH ₂	Me
J-29 (3/5)	Q-72	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	6-Cl	Me
J-29 (3/5)	Q-75	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	6-Me	Me
J-29 (3/5)	Q-78	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	6-NO ₂	Me
J-29 (3/5)	Q-79	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	6-NH ₂	Me
J-29 (3/5)	Q-86	-	Me	J-29 (3/5)	Q-72	5,6-di-Cl	Me

表 16



在表 16 中，J (如 J-69) 的結構在上面實施例中的示例 3 中示出。J 後面括號中的數字指上述結構中 J 環與噻唑環和 Z² 的連接點。第一個數字為 J 上與噻唑環連接的環位置，第二個數字為 J 上與 Z² 連接的環位置。下列 (R⁶)_x 列指出連接至 J 環且非上述結構中 -Z²Q 取代基的取代基。下列 Z² 列中的折號「-」指出直接鍵。Q (如 Q-1) 的結構在上面實施例中的示例 5 中示出其中 g 為 0 而 R^{6c} 取代基為氫。下列 (R^{6a})_p 列指出連接至 Q 環的取代基。

J	Z ²	R ⁶	(R ^{6a}) _p	Q	J	Z ²	R ⁶	(R ^{6a}) _p	Q
J-69 (1/4)	O	H	H	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	3- MeS(=O) ₂	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-1	J-29 (3/5)	-	H	3-MeNH	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-2	J-29 (3/5)	-	H	4-(Me) ₂ N	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-4	J-29 (3/5)	-	H	2-MeOCH ₂	Q-45
J-2 9(3/5)	-	H	H	Q-5	J-29 (3/5)	-	H	3- MeC(O) ₂	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-6	J-29 (3/5)	-	H	3-MeNHC(O)	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-7	J-29(3/5)	-	H	4-MeOC(O)O	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-8	J-29 (3/5)	-	H	4-MeC(O)S	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-9	J-29 (3/5)	-	H	3-(Me) ₂ NC(O)	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-15	J-29 (3/5)	-	H	4-Me ₃ Si	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-16	J-29 (3/5)	-	H	2,6-di-Et	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-17	J-29 (3/5)	-	H	2,6-di-Cl	Q-45
J-29(3/5)	-	H	H	Q-18	J-29 (3/5)	-	H	2-OH	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-19	J-29 (3/5)	-	H	4-CHF ₂ O	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-20	J-26 (2/5)	-	-	-CH ₂ CH ₂ - [Note 1]	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-24	J-26 (3/5)	-	-	1-Me, -CH ₂ CH ₂ - [附註 1]	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-25	J-26 (2/5)	CH ₂	H	4-OH	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-26	J-26 (2/5)	CH ₂	H	4-MeO	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-27	J-26 (2/4)	CH ₂	H	4-OH	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-29	J-26 (2/4)	CH ₂	H	4-MeO	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-30	J-25 (2/4)	CH ₂	H	4-OH	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-32	J-25 (2/4)	CH ₂	H	4-MeO	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-33	J-1 (2/4)	-	5-Me	2,6-di-F	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-34	J-3 (2/5)	-	-	-CH ₂ CH ₂ - [附註 2]	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-35	J-29 (3/5)	NH ₂	H	2,6-di-F	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-36	J-29 (3/5)	NMe	H	2,6-di-F	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-36	J-29 (3/5)	NEt	H	2,6-di-F	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-37	J-29 (3/5)	Nn-Pr	H	2,6-di-F	Q-45
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-38	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-39	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-40	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-73
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-41	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-74
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-42	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-76
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-43	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-77
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-44	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-80
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-46	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-81
J-29 (3/5)	CH ₂	H	H	Q-47	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-82

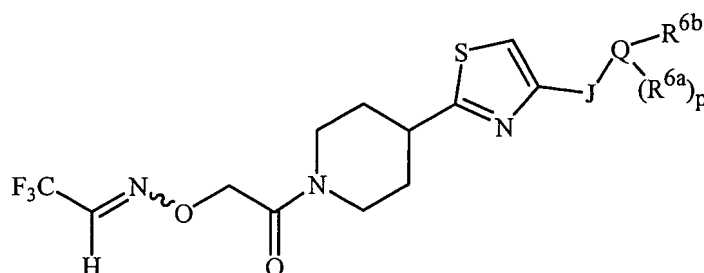
J	Z ²	R ⁶	(R ^{6a}) _p	Q	J	Z ²	R ⁶	(R ^{6a}) _p	Q
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-48	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-83
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-49	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-84
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-50	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-85
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-51	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-89
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-52	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-90
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-53	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-91
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-54	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-93
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-55	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-94
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-56	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-96
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-57	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-97
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-58	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-98
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-59	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-99
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-60	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-100
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-61	J-29 (3/5)	-	H	H	Q-101
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-61	J-29 (3/5)	-	H	4-Cl	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-61	J-29 (3/5)	-	H	5-Cl	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-62	J-29 (3/5)	-	H	6-Cl	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-63	J-29 (3/5)	-	H	7-Cl	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-64	J-29 (3/5)	-	H	4-Me	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-65	J-29 (3/5)	-	H	5-Me	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-66	J-29 (3/5)	-	H	6-Me	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-67	J-29 (3/5)	-	H	5-CF ₃	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-68	J-29 (3/5)	-	H	5-NO ₂	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	H	Q-69	J-29 (3/5)	-	H	6-Br	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	2-Me	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	6-NO ₂	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	3-Me	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	6-NH ₂	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	4-Me	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	6-MeO	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	2-Cl	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5,6-di-MeO	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	3-Cl	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5,6-di-Cl	Q-71
J-29 (3/5)	-	H	4-Cl	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-Cl	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	2-MeO	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-Me	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	3-MeO	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-NO ₂	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	4-MeO	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-NH ₂	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	2-Et	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	6-Cl	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	3- <i>i</i> -Pr	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	6-Me	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	2,6-di-Me	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	6-NO ₂	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	4-CH ₂ =CH	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	6-NH ₂	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	4-CH≡C	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5,6-di-Cl	Q-70
J-29 (3/5)	-	H	4- <i>c</i> -Pr	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-Cl,6-OH	Q-70

J	Z ²	R ⁶	(R ^{6a}) _p	Q	J	Z ²	R ⁶	(R ^{6a}) _p	Q
J-29 (3/5)	-	H	3-CF ₃	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	4-Me	Q-63
J-29 (3/5)	-	H	3-CF ₃ O	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	4-NO ₂	Q-63
J-29 (3/5)	-	H	4-Br	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	4-NH ₂	Q-63
J-29 (3/5)	-	H	3-OH	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-Cl	Q-63
J-29 (3/5)	-	H	3-NH ₂	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-Me	Q-63
J-29 (3/5)	-	H	2-CN	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-CN	Q-63
J-29 (3/5)	-	H	4- <i>t</i> -BuO	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-NO ₂	Q-63
J-29(3/5)	-	H	4-MeS	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-NH ₂	Q-63
J-29 (3/5)	-	H	4-CF ₃ S	Q-45	J-29 (3/5)	-	H	5-MeCO ₂	Q-63
					J-29 (3/5)	-	H	5,6-di-Cl	Q-63

[附註 1]: 由在 J-26 的 4 位置的 R⁶ 與在 Q-45 的 2 位置的 R^{6a} 一起形成。

[附註 2]: 由在 J-3 的 1 位置的 R⁶ 與在 Q-45 的 2 位置的 R^{6a} 一起形成。

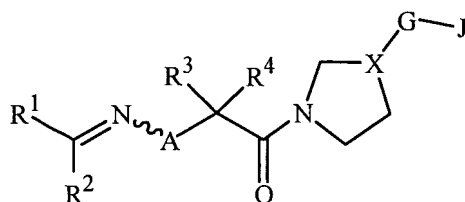
表 17



在表 17 中，J(如 J-29) 的結構在上面實施例中的示例 3 中示出其中 x 為 1、R⁶ 為 Q 且 Z² 為直接鍵。J 後面括號中的數字指 J 環與噻唑環和 Q 的連接點。第一個數字為 J 上與噻唑環連接的環位置，第二個數字為 J 上與 Q 連接的環位置。Q 的結構(如 Q-87) 在上面實施例中的示例 5 中示出其中 g 為 1。下列(R^{6a})_p 與 R^{6b} 列出連接至 Q 的取代基。

J	Q	(R ^{6a}) _p	R ^{6b}
J-29 (3/5)	Q-87		4-Ph
J-29 (3/5)	Q-45	6-F	2-Ph
J-29 (3/5)	Q-45		2-(1 <i>H</i> -咪唑-2-基)
J-29 (3/5)	Q-45		2-(1 <i>H</i> -吡唑-1-基)
J-29 (3/5)	Q-45		2-(1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基)
J-29 (3/5)	Q-45		2-(1 <i>H</i> -1,2,4-三唑-1-基)

表 18



在表 18 中，G -1 與 G-2 的結構在上面實施例中的示例 2 中示出，其中在上述結構中向左伸出的鍵連接至 X，向右伸出的鍵連接至 J。在示例 2 中示出的連接至 G 的 R^{26a} 取代基為 H。

J 為 C(=W²)NT^AT^B 且 W² 為 O。

R ¹	R ²	A	X	G	NT ^A T ^B
----------------	----------------	---	---	---	--------------------------------

CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基丙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氰基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基丙基胺基

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R^1	R^2	A	X	G	$NT^A T^B$
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氰基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯乙基胺基

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R^1	R^2	A	X	G	$NT^A T^B$
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基丙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茛基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R^1	R^2	A	X	G	$NT^A T^B$
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯丙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氰基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基

J 為 C(=W²)NT^AT^B 且 W² 為 O。

R ¹	R ²	A	X	G	NT ^A T ^B
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯丙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茚基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基

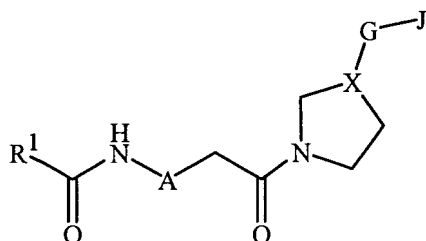
J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R^1	R^2	A	X	G	$NT^A T^B$
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基丙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茛基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氰基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R^1	R^2	A	X	G	$NT^A T^B$
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
CF ₃	H	-O-	X ¹	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ¹	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ¹	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-O-	X ²	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ²	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ²	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-O-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-NH-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	O-	X ²	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ²	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ²	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-O-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-NH-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	X ²	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基

表 19



在表 19 中，G-1 與 G-2 的結構在上面實施例中的示例 2 中示出，其中在上述結構中向左伸出的鍵連接至 X，向右伸出的鍵連接至 J。在示例 2 中示出的連接至 G 的 R^{26a} 取代基為 H。

J 為 C(=W²)NT^AT^B 且 W² 為 O。

R ¹	A	X	G	NT ^A T ^B
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基丙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茚基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R^1	A	X	G	$NT^A T^B$
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟基苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基丙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R^1	A	X	G	$NT^A T^B$
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茚基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茚基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氰基苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R^1	A	X	G	$NT^A T^B$
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	-NH-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基丙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茛基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茛基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R^1	A	X	G	$NT^A T^B$
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氰基苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丁基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯丙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-4-羥基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基

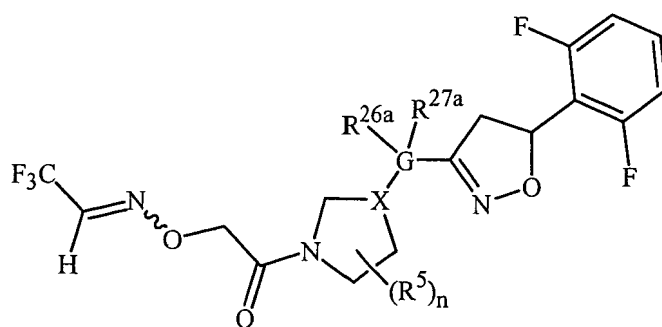
J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R^1	A	X	G	$NT^A T^B$
CF ₃	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-4-側氧-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-二氫茚基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	N,2-二甲基-1-二氫茚基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	N,2,2-三甲基-1-二氫茚基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-3-羥基-1-二氫茚基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	N-甲基-3-側氧-1-二氫茚基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-乙基-1-苯乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-丙基-1-苯乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-NH-1-苯乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲基苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氯苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-溴苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-氟基苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-三氟甲基苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2-甲氧基苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲基苯基)乙基胺基
Me	-O-	X ¹	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二甲氧基苯基)乙基胺基

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$ 且 W^2 為 O。

R ¹	A	X	G	NT ^A T ^B
CF ₃	-O-	X1	G-1	(1R)-N-甲基-1-苯基乙基胺基
Me	-O-	X1	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)乙基胺基
Me	-O-	X1	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)乙基胺基
Me	-O-	X1	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氟苯基)丙基胺基
Me	-O-	X1	G-1	(1R)-N-甲基-1-(2,6-二氯苯基)丁基胺基
Me	-NH-	X1	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
Me	-N(CH ₃)-	X1	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O	X2	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-NH-	X2	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X2	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O-	X1	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-NH-	X1	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X1	G-2	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-O-	X2	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-NH-	X2	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基
CF ₃	-N(CH ₃)-	X2	G-1	(1R)-N-甲基-1,2,3,4-四氫-1-萘基胺基

表 20



在表 20 中，G (如 G-1) 的結構在上面實施例中的示例 2 中示出，其中在上述結構中向左伸出的鍵連接至 X，向右伸出的鍵連接至異噁唑環。下列 $(R^5)_n$ 列中的短劃線「-」指出 R^5 取代基在含有 X 的環的位置並相對於在該環上的氮原子。下列 R^{27a} 列中的短劃線「-」指出 R^{27a} 存在於示例 2 中示出的 G 環。

X	$(R^5)_n$	G	R^{26a}	R^{27a}
X ¹	-	G-1	H	-
X ¹	-	G-2	H	-
X ¹	-	G-3	H	H
X ¹	-	G-4	H	-
X ¹	-	G-5	H	-
X ¹	-	G-6	H	H
X ¹	-	G-7	H	-
X ¹	-	G-8	H	-
X ¹	-	G-9	H	H
X ¹	-	G-10	H	-
X ¹	-	G-11	H	-
X ¹	-	G-12	H	H
X ¹	-	G-13	H	H
X ¹	-	G-14	H	-
X ¹	-	G-15	H	-
X ¹	-	G-16	H	H
X ¹	-	G-17	H	-
X ¹	-	G-18	H	-
X ¹	-	G-19	H	H
X ¹	-	G-20	H	-
X ¹	-	G-21	H	-

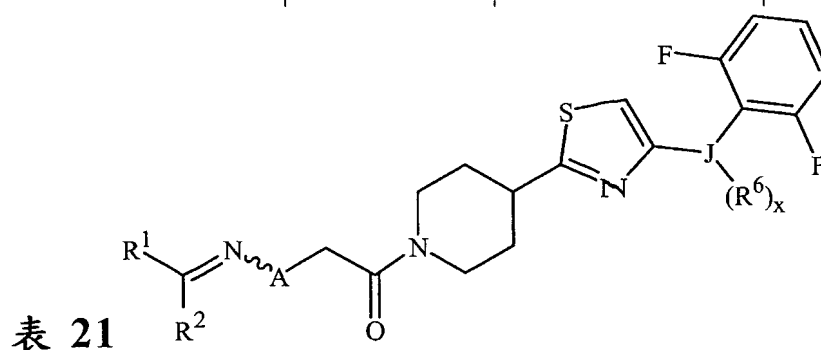
X	(R ⁵) _n	G	R ^{26a}	R ^{27a}
X ¹	-	G-22	H	H
X ¹	-	G-23	H	-
X ¹	-	G-24	H	-
X ¹	-	G-25	H	-
X ¹	-	G-26	H	-
X ¹	-	G-27	H	-
X ¹	-	G-28	H	-
X ¹	-	G-29	H	-
X ¹	-	G-30	H	-
X ¹	-	G-31	H	-
X ¹	-	G-32	H	-
X ¹	-	G-33	H	-
X ¹	-	G-34	H	-
X ¹	-	G-35	H	-
X ¹	-	G-36	H	-
X ¹	-	G-37	H	-
X ¹	-	G-38	H	-
X ¹	-	G-39	H	H
X ¹	-	G-40	H	-
X ¹	-	G-41	H	-
X ¹	-	G-42	H	H
X ¹	-	G-43	H	H
X ¹	-	G-44	H	-
X ¹	-	G-45	H	-
X ¹	-	G-46	H	-
X ¹	-	G-47	H	-
X ¹	-	G-48	H	H
X ¹	-	G-49	H	-
X ¹	-	G-50	H	-
X ¹	-	G-51	H	H
X ¹	-	G-52	H	-
X ¹	-	G-53	H	-
X ¹	-	G-54	H	H
X ¹	-	G-55	H	-
X ¹	-	G-56	H	-
X ¹	-	G-57	H	-
X ¹	-	G-58	H	H
X ¹	-	G-59	H	H
X ¹	-	G-2	Me	-

X	(R ⁵) _n	G	R ^{26a}	R ^{27a}
X ¹	-	G-2	Cl	-
X ¹	-	G-2	F	-
X ¹	-	G-2	CF ₃	-
X ¹	-	G-14	<i>n</i> -Pr	-
X ¹	-	G-3	H	Me
X ¹	-	G-3	H	<i>n</i> -Pr
X ¹	-	G-26	5-Me	-
X ¹	2-Me	G-1	H	-
X ¹	3-Me	G-1	H	-
X ¹	2,6-di-Me	G-1	H	-
X ¹	3,5-di-Me	G-1	H	-
X ¹	3- <i>n</i> -Bu	G-1	H	-
X ¹	4-MeO	G-1	H	-
X ¹	4-OH	G-1	H	-
X ¹	4-Cl	G-1	H	-
X ¹	4-Br	G-1	H	-
X ¹	4-CN	G-1	H	-
X ²	-	G-1	H	-
X ²	-	G-2	H	-
X ²	-	G-3	H	H
X ²	-	G-4	H	-
X ²	-	G-5	H	-
X ²	-	G-6	H	H
X ²	-	G-7	H	-
X ²	-	G-8	H	-
X ²	-	G-9	H	H
X ²	-	G-10	H	-
X ²	-	G-11	H	-
X ²	-	G-12	H	H
X ²	-	G-13	H	H
X ²	-	G-14	H	-
X ²	-	G-15	H	-
X ²	-	G-16	H	H
X ²	-	G-17	H	-
X ²	-	G-18	H	-
X ²	-	G-19	H	H
X ²	-	G-20	H	-
X ²	-	G-21	H	-
X ²	-	G-22	H	H

X	(R ⁵) _n	G	R ^{26a}	R ^{27a}
X ²	-	G-23	H	-
X ²	-	G-24	H	-
X ²	-	G-31	H	-
X ²	-	G-32	H	-
X ²	-	G-33	H	-
X ²	-	G-34	H	-
X ²	-	G-35	H	-
X ²	-	G-37	H	-
X ²	-	G-38	H	-
X ²	-	G-39	H	H
X ²	-	G-40	H	-
X ²	-	G-41	H	-
X ²	-	G-42	H	H
X ²	-	G-43	H	H
X ²	-	G-44	H	-
X ²	-	G-45	H	-
X ²	-	G-46	H	-
X ²	-	G-47	H	-
X ²	-	G-48	H	H
X ²	-	G-49	H	-
X ²	-	G-50	H	-
X ²	-	G-51	H	H
X ²	-	G-52	H	-
X ²	-	G-53	H	-
X ²	-	G-54	H	H
X ²	-	G-2	Me	-
X ²	-	G-2	Cl	-
X ²	-	G-2	F	-
X ²	-	G-2	CF ₃	-
X ²	-	G-14	<i>n</i> -Pr	-
X ²	-	G-3	H	Me
X ²	-	G-3	H	<i>n</i> -Pr
X ²	2-Me	G-1	H	-
X ²	3-Me	G-1	H	-
X ²	2,6-di-Me	G-1	H	-
X ²	3,5-di-Me	G-1	H	-
X ²	3- <i>n</i> -Bu	G-1	H	-
X ³	-	G-1	H	-
X ³	-	G-2	H	-

X	(R ⁵) _n	G	R26a	R27a
X ³	-	G-3	H	H
X ³	-	G-4	H	-
X ³	-	G-5	H	-
X ³	-	G-6	H	H
X ³	-	G-7	H	-
X ³	-	G-8	H	-
X ³	-	G-9	H	H
X ³	-	G-10	H	-
X ³	-	G-11	H	-
X ³	-	G-12	H	H
X ³	-	G-13	H	H
X ³	-	G-14	H	-
X ³	-	G-15	H	-
X ³	-	G-16	H	H
X ³	-	G-17	H	-
X ³	-	G-18	H	-
X ³	-	G-19	H	H
X ³	-	G-20	H	-
X ³	-	G-21	H	-
X ³	-	G-22	H	H
X ³	-	G-23	H	-
X ³	-	G-24	H	-
X ³	-	G-31	H	-
X ³	-	G-32	H	-
X ³	-	G-33	H	-
X ³	-	G-34	H	-
X ³	-	G-35	H	-
X ³	-	G-37	H	-
X ³	-	G-38	H	-
X ³	-	G-39	H	H
X ³	-	G-40	H	-
X ³	-	G-41	H	-
X ³	-	G-42	H	H
X ³	-	G-43	H	H
X ³	-	G-44	H	-
X ³	-	G-45	H	-
X ³	-	G-46	H	-
X ³	-	G-47	H	-
X ³	-	G-48	H	H

X	(R ⁵) _n	G	R ^{26a}	R ^{27a}
X ³	-	G-49	H	-
X ³	-	G-50	H	-
X ³	-	G-51	H	H
X ³	-	G-52	H	-
X ³	-	G-53	H	-
X ³	-	G-54	H	H
X ³	-	G-2	Me	-
X ³	-	G-2	Cl	-
X ³	-	G-2	F	-
X ³	-	G-2	CF ₃	-
X ³	-	G-14	<i>n</i> -Pr	-
X ³	-	G-3	H	Me
X ³	-	G-3	H	<i>n</i> -Pr
X ³	2-Me	G-1	H	-
X ³	3-Me	G-1	H	-
X ³	2,6-di-Me	G-1	H	-
X ³	3,5-di-Me	G-1	H	-
X ³	3- <i>n</i> -Bu	G-1	H	-
X ³	5-Me	G-1	H	-
X ³	6-Me	G-1	H	-
X ⁴	-	G-1	H	-
X ⁵	-	G-1	H	-
X ⁶	-	G-1	H	-
X ⁷	-	G-1	H	-
X ⁸	-	G-1	H	-
X ⁹	-	G-1	H	-



在表 21 中，J (如 J-1) 的結構在上面實施例中的示例 3 中示出。J 後面括號中的數字指上述結構中 J 環與噻唑環和 2,6-二氟苯基環的連接點。第一個數字為 J

上與噻唑環連接的環位置，第二個數字為 J 上與 2,6-二氟苯基環連接的環位置。下列(R⁶)_x 列指出非為上述結構中的 2,6-二氟苯基的 R⁶ 取代基。

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	H	-O-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	Me	-O-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	H	-NH-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-1 (2/4)	H
Me	Me	-O-	J-1 (2/4)	H
Me	Me	-NH-	J-1 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-1 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-1 (2/4)	H
CF ₃	H	-O-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	Me	-O-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	H	-NH-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-2 (2/4)	H
Me	Me	-O-	J-2 (2/4)	H
Me	Me	-NH-	J-2 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-2 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-2 (2/4)	H
CF ₃	H	-O-	J-3 (2/4)	1-Me
CF ₃	Me	-O-	J-3 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-NH-	J-3 (2/4)	1-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-3 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-3 (2/4)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-3 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-3 (2/4)	1-Me

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-3 (2/4)	1-Me
Me	Me	-O-	J-3 (2/4)	1-Me
Me	Me	-NH-	J-3 (2/4)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-3 (2/4)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-3 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-O-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-4 (2/5)	H
Me	Me	-O-	J-4 (2/5)	H
Me	Me	-NH-	J-4 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-4 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-4 (2/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	Me	-O-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	H	-NH-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-8 (5/3)	H
Me	Me	-O-	J-8 (5/3)	H
Me	Me	-NH-	J-8 (5/3)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-8 (5/3)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-8 (5/3)	H
CF ₃	H	-O-	J-9 (5/3)	H
CF ₃	Me	-O-	J-9 (5/3)	H
CF ₃	H	-NH-	J-9 (5/3)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-9 (5/3)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-9 (5/3)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-9 (5/3)	H

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-9 (5/3)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-9 (5/3)	H
Me	Me	-O-	J-9 (5/3)	H
Me	Me	-NH-	J-9 (5/3)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-9 (5/3)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-9 (5/3)	H
CF ₃	H	-O-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-11 (3/5)	H
Me	Me	-O-	J-11 (3/5)	H
Me	Me	-NH-	J-11 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-11 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-11 (3/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-12 (3/5)	H
Me	Me	-O-	J-12 (3/5)	H
Me	Me	-NH-	J-12 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-12 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-12 (3/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-12 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-O-	J-12 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-NH-	J-12 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-12 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-12 (3/5)	1-Me

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-12 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-12 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-12 (3/5)	1-Me
Me	Me	-O-	J-12 (3/5)	1-Me
Me	Me	-NH-	J-12 (3/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-12 (3/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-12 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-O-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-14 (3/5)	H
Me	Me	-O-	J-14 (3/5)	H
Me	Me	-NH-	J-14 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-14 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-14 (3/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-15 (2/5)	H
Me	Me	-O-	J-15 (2/5)	H
Me	Me	-NH-	J-15 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-15 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-15 (2/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-16 (2/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-16 (2/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-16 (2/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-16 (2/5)	H

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-16 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-16 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-16 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-16 (2/5)	H
Me	Me	-O-	J-16 (2/5)	H
Me	Me	-NH-	J-16 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-16 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-16 (2/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	Me	-O-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	H	-NH-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-22 (2/4)	H
Me	Me	-O-	J-22 (2/4)	H
Me	Me	-NH-	J-22 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-22 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-22 (2/4)	H
CF ₃	H	-O-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	Me	-O-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	H	-NH-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-24 (2/4)	H
Me	Me	-O-	J-24 (2/4)	H
Me	Me	-NH-	J-24 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-24 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-24 (2/4)	H
CF ₃	H	-O-	J-25 (2/4)	H
CF ₃	Me	-O-	J-25 (2/4)	H
CF ₃	H	-NH-	J-25 (2/4)	H

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	Me	-NH-	J-25 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-25 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-25 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-25 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-25 (2/4)	H
Me	Me	-O-	J-25 (2/4)	H
Me	Me	-NH-	J-25 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-25 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-25 (2/4)	H
CF ₃	H	-O-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	Me	-O-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	H	-NH-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/4)	H
Me	Me	-O-	J-26 (2/4)	H
Me	Me	-NH-	J-26 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-26 (2/4)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/4)	H
CF ₃	H	-O-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	Me	-O-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-NH-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/4)	1-Me
Me	Me	-O-	J-26 (2/4)	1-Me
Me	Me	-NH-	J-26 (2/4)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-26 (2/4)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/4)	1-Me
CF ₃	H	-O-	J-26 (2/5)	1-Me
CF ₃	Me	-O-	J-26 (2/5)	1-Me

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	H	-NH-	J-26 (2/5)	1-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-26 (2/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-26 (2/5)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-26 (2/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/5)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/5)	1-Me
Me	Me	-O-	J-26 (2/5)	1-Me
Me	Me	-NH-	J-26 (2/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-26 (2/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-26 (2/5)	1-Me
CF ₃	H	-O-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-28 (3/5)	H
Me	Me	-O-	J-28 (3/5)	H
Me	Me	-NH-	J-28 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-28 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-28 (3/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-30 (3/5)	H
Me	Me	-O-	J-30 (3/5)	H
Me	Me	-NH-	J-30 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-30 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-30 (3/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-30 (3/5)	1-Me

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	Me	-O-	J-30 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-NH-	J-30 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-30 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-30 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-30 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-30 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-30 (3/5)	1-Me
Me	Me	-O-	J-30 (3/5)	1-Me
Me	Me	-NH-	J-30 (3/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-30 (3/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-30 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-O-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-O-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-NH-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-36 (3/5)	1-Me
Me	Me	-O-	J-36 (3/5)	1-Me
Me	Me	-NH-	J-36 (3/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-36 (3/5)	1-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-36 (3/5)	1-Me
CF ₃	H	-O-	J-37 (2/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-37 (2/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-37 (2/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-37 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-37 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-37 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-37 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-37 (2/5)	H
Me	Me	-O-	J-37 (2/5)	H
Me	Me	-NH-	J-37 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-37 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-37 (2/5)	H

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
CF ₃	H	-O-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-38 (2/5)	H
Me	Me	-O-	J-38 (2/5)	H
Me	Me	-NH-	J-38 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-38 (2/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-38 (2/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-39 (3/5)	H
Me	Me	-O-	J-39 (3/5)	H
Me	Me	-NH-	J-39 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-39 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-39 (3/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	Me	-O-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	H	-NH-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-40 (3/5)	H
Me	Me	-O-	J-40 (3/5)	H
Me	Me	-NH-	J-40 (3/5)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-40 (3/5)	H

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-40 (3/5)	H
CF ₃	H	-O-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	Me	-O-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	H	-NH-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-69 (1/3)	H
Me	Me	-O-	J-69 (1/3)	H
Me	Me	-NH-	J-69 (1/3)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-69 (1/3)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-69 (1/3)	H
CF ₃	H	-O-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	Me	-O-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	H	-NH-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	Me	-NH-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-69 (1/4)	H
Me	Me	-O-	J-69 (1/4)	H
Me	Me	-NH-	J-69 (1/4)	H
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-69 (1/4)	H
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-69 (1/4)	H
CF ₃	H	-O-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	Me	-O-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	H	-NH-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	5-Me
Me	Me	-O-	J-29 (3/5)	5-Me
Me	Me	-NH-	J-29 (3/5)	5-Me

R ¹	R ²	A	J	(R ⁶) _x
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	5-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	5-Me
CF ₃	H	-O-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	Me	-O-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	H	-NH-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	4-Me
Me	Me	-O-	J-29 (3/5)	4-Me
Me	Me	-NH-	J-29 (3/5)	4-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	4-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	4-Me
CF ₃	H	-O-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
CF ₃	Me	-O-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
CF ₃	H	-NH-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
CF ₃	Me	-NH-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
CF ₃	H	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
CF ₃	H	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
CF ₃	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
Me	Me	-O-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
Me	Me	-NH-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
Me	Me	-N(CH ₃)-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me
Me	Me	-N(CH ₂ CH ₃)-	J-29 (3/5)	4,4-di-Me

製劑/效用

本發明的式 1 化合物將通常作為殺真菌活性成分，與至少一種選自表面活性劑、固體稀釋劑和液體稀釋劑（作為載體）一起用於組合物（即製劑）中。還可使用在排除式 1 的前提條件(a)的範圍內的化合物。對製

劑或組合物成分進行選擇以與活性成分的物理性質、施用模式和諸如土壤類型、濕度和溫度之類的環境因素相符合。

可用的製劑包括液體組合物和固體組合物兩者。液體組合物包括溶液劑（包括乳油）、懸浮劑、乳劑（包括微乳劑和/或懸乳劑）等，可任選將其增稠成凝膠劑。一般的水性液體組合物類型是可溶液劑、懸浮劑、微囊懸浮劑、濃乳劑、微乳劑和懸乳劑。一般的非水性液體組合物類型是乳油、微乳油、可分散液劑和油分散體。

一般的固體組合物類型是粉塵劑、粉劑、顆粒劑、球劑、丸劑、錠劑、片劑、填充膜劑（包括種子包衣）等，其可以是水分散性的（「可濕的」）或水溶性的。用成膜溶液或可流動混懸液形成的膜和包衣尤其可用於種子處理。活性成分可進行(微)膠囊包封並進一步形成懸浮劑或固體製劑；作為另一種選擇，可對整個活性成分的製劑進行包封（或「加護膜」）。封裝可控制或延緩活性成分的釋放。可乳化顆粒結合了乳油製劑和乾顆粒狀製劑兩者的優勢。高濃度組合物主要用作中間體，用於進一步配製。

在噴施前，可噴施的製劑通常在合適的介質中擴充。這種液體和固體製劑被配製成易於在這種噴霧介質（通常是水）中稀釋。噴霧劑體積可在每公頃 1 升至數千升的範圍內，但更通常是在每公頃約 10 至數百升的範圍內。可噴施的製劑可與水或另一種合適的介質在罐內混合，用於通過空中噴藥或地面噴藥對葉片進行處理，或用於給植物的生長培養基噴藥。可在種植期間，

將液體和乾製劑直接定量供應給滴灌系統或定量供應進壟溝中。可將液體和固體製劑施加至穀物或其他所欲植生的種子上作為種植前的種子處理，以保護髮育的根和其他地下植物部分和/或通過系統攝取而保護葉子。

該製劑將通常含有有效量的活性成分、稀釋劑和表面活性劑，處於下面配方表中的大概範圍內，這些成分的配方合計為 100 重量百分比。

	重量百分比		
	活性成分	稀釋劑	表面活性劑
水分散性和水溶性顆粒劑、片劑和粉劑	0.001-90	0-99.999	0-15
油分散體、懸浮劑、乳劑、溶液劑 (包括乳油)	1-50	40-99	0-50
粉塵劑	1-25	70-99	0-5
顆粒劑和球劑	0.001-95	5-99.999	0-15
高濃度組合物	90-99	0-10	0-2

固體稀釋劑包括(例如):黏土類如膨潤土、蒙脫石、綠坡縷石和高嶺土;石膏;纖維素;二氧化鈦;氧化鋅;澱粉;糊精;糖類(如乳糖、蔗糖);二氧化矽;滑石;雲母;矽藻土;尿素;碳酸鈣;碳酸鈉和碳酸氫鈉;以及硫酸鈉。代表性的固體稀釋劑在 Watkins 等人, *Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers*, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey 中有所描述。

液體稀釋劑包括(例如)水、*N,N*-二甲基烷醯胺(如 *N,N*-二甲基甲醯胺)、檸檬烯、二甲基亞砷、*N*-烷基吡

咯烷酮（如 *N*-甲基吡咯烷酮）、乙二醇、三甘醇、丙二醇、雙丙甘醇、聚丙二醇、碳酸丙二酯、碳酸丁二酯、石蠟（如石蠟油、正構烷烴、異鏈烷烴）、烷基苯、烷基萘、甘油、甘油三醋酸酯、山梨醇、芳族烴、去芳脂族化合物、烷基苯、烷基萘、酮類（例如環己酮、2-庚酮、異佛樂酮和 4-羥基-4-甲基-2-戊酮）、醋酸酯類（例如醋酸異戊酯、醋酸己酯、醋酸庚酯、醋酸辛酯、醋酸壬酯、醋酸十三烷基酯和醋酸異冰片酯）、其他酯類（例如烷基化乳酸酯、二元酯和 γ -丁內酯），以及醇類，其可以是直鏈的、支鏈的、飽和的或不飽和的，例如甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、正己醇、2-以及己醇、正辛醇、癸醇、異癸醇、異硬脂醇、鯨蠟醇、月桂醇、十三醇、油醇、環己醇、四氫糠醇、二丙酮醇和苜醇。液體稀釋劑還包括飽和和不飽和脂肪酸（通常為 C_6 - C_{22} ）的甘油酯，例如植物種子和果實油（如橄欖、蓖麻、亞麻籽、芝麻、玉米（玉蜀黍）、花生、向日葵、葡萄籽、紅花、棉籽、大豆、油菜籽、椰子和棕櫚仁的油）、動物源脂肪（如牛脂、豬脂、豬油、鱈魚肝油、魚油）以及它們的混合物。液體稀釋劑還包括烷基化脂肪酸（如甲基化、乙基化、丁基化脂肪酸），其中脂肪酸可通過使植物和動物來源的甘油酯水解而獲得，並且可通過蒸餾純化。代表性的液體稀釋劑在 Marsden, *Solvents Guide*, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950 中有所描述。

本發明的固體和液體組合物通常包括一種或多種表面活性劑。當添加至一液體時，表面活性劑（亦已知

為「界面活性劑」)一般可改變，最常為降低液體的表面張力。取決於表面活性劑分子中的親水或疏水基團本質，表面活性劑可作為濕潤劑、分散劑、乳化劑或去泡劑。

表面活性劑可分為非離子型、陰離子型或陽離子型。可用於本發明的非離子型表面活性劑包括，但不限於：醇烷氧基化物，例如基於天然醇和合成醇（其可以是支鏈或直鏈醇）並用醇和環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或它們的混合物製備的醇烷氧基化物；胺乙氧基化物、烷醇醯胺和乙氧基化烷醇醯胺；烷氧基化三甘油酯，例如乙氧基化的大豆油、蓖麻油和油菜籽油；烷基酚烷氧基化物，例如辛基酚乙氧基化物、壬基酚乙氧基化物、二壬基酚乙氧基化物和十二烷基酚乙氧基化物（用酚和環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或它們的混合物製備）；用環氧乙烷或環氧丙烷製備的嵌段聚合物和其中末端鏈段是用環氧丙烷製備的反向嵌段聚合物；乙氧基化脂肪酸；乙氧基化脂肪酯和乙氧基化油；乙氧基化甲基酯；乙氧基化三苯乙烯苯酚（包括用環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或它們的混合物製備的那些）；脂肪酸酯、甘油酯、羊毛脂基衍生物、聚乙氧基化酯例如聚乙氧基化去水山梨糖醇脂肪酸酯、聚乙氧基化山梨醇脂肪酸酯和聚乙氧基化甘油脂肪酸酯；其他去水山梨糖醇衍生物，例如去水山梨糖醇酯；聚合物表面活性劑，例如無規共聚物、嵌段共聚物、醇酸 peg（聚乙二醇）樹脂、接枝聚合物或梳型聚合物和星型聚合物；聚乙二

醇類(peg)；聚乙二醇脂肪酸酯；有機矽劑表面活性劑；以及糖衍生物，例如蔗糖酯、烷基多聚糖甘和烷基多糖。

可用的陰離子型表面活性劑包括，但不限於：烷芳基磺酸以及它們的鹽；羧化醇或烷基酚乙氧基化物；二苯基磺酸鹽衍生物；木質素和木質素衍生物，例如木質素磺酸鹽；馬來酸或琥珀酸或它們的酸酐；烯烴磺酸鹽；磷酸酯，例如醇烷氧基化物的磷酸酯、烷基酚烷氧基化物的磷酸酯和苯乙烯基苯酚乙氧基化物的磷酸酯；蛋白質基表面活性劑；肌胺酸衍生物；苯乙烯基苯酚醚硫酸鹽；油和脂肪酸的硫酸鹽和磺酸鹽；醇的硫酸酯鹽；乙氧基化醇的硫酸酯鹽；胺和醯胺的磺酸鹽，例如 *N,N*-烷基牛磺酸鹽；苯、異丙基苯、甲苯、二甲苯以及十二烷基苯和十三烷基苯的磺酸鹽；稠合萘的磺酸鹽；萘和烷基萘的磺酸鹽；分餾石油的磺酸鹽；磺基琥珀醯胺酸鹽；和磺基琥珀酸鹽以及它們的衍生物如二烷基磺基琥珀醯胺酸鹽。

可用的陽離子型表面活性劑包括，但不限於：醯胺和乙氧基化醯胺；胺，例如 *N*-烷基丙二胺、三亞丙基三胺和二亞丙基四胺和乙氧基化胺、乙氧基化二胺和丙氧基化胺（用胺和環氧乙烷、環氧丙烷、環氧丁烷或它們的混合物製備）；胺鹽如醋酸胺和二胺鹽；四級銨鹽類，例如四級銨鹽、乙氧基化四級銨鹽和雙四級銨鹽；以及胺氧化物，例如烷基二甲基胺氧化物和雙-(2-羥乙基)-烷基胺氧化物。

還可用於本發明組合物的是非離子型表面活性劑和陰離子型表面活性劑的混合物或非離子型表面活性

劑和陽離子型表面活性劑的混合物。非離子型、陰離子型和陽離子型表面活性劑以及它們的推薦用法在多篇已公佈的參考文獻中有公開，包括 *McCutcheon's Emulsifiers and Detergents*, annual American and International Editions (由 McCutcheon 的分部，The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 出版)；Sisely 和 Wood, *Encyclopedia of Surface Active Agents*, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964；以及 A. S. Davidson 和 B. Milwidsky, *Synthetic Detergents*, Seventh 編輯，John Wiley and Sons, New York, 1987。

本發明的組合物還可以含有配方輔助劑和添加劑，本領域人員稱為配方助劑。這種配方助劑和添加劑可以控制：pH (緩衝劑)、加工期間的發泡 (消泡劑，例如聚有機矽氧烷 (如 Rhodorsil® 416))、活性成分的沉澱 (助懸劑)、黏度 (觸變增稠劑)、容器內的微生物生長 (抗微生物劑)、產品凍結 (防凍劑)、顏色 (染料/顏料分散體 (如 Pro-lzed® 紅著色劑)、洗脫 (成膜劑或黏著劑)、蒸發 (蒸發延緩劑) 和其他製劑屬性。成膜劑包括，例如聚醋酸乙烯酯、聚醋酸乙烯酯共聚物、聚乙烯基吡咯烷酮-醋酸乙烯基酯共聚物、聚乙烯醇、聚乙烯醇共聚物和蠟。配方輔助劑和添加劑的例子包括在 *McCutcheon's* 第 2 卷：*Functional Materials*, annual International and North American editions (由 McCutcheon 的部門 The Manufacturing Confectioner Publishing Co. 出版)；和 PCT 公開申請案第 WO 03/024222 號中列出的那些。

可通過將成分簡單混合而製備溶液劑，包括乳油。如果旨在用作乳油的液體組合物的溶劑是不能與水混溶的，則通常加入乳化劑以在用水稀釋時使含有活性劑的溶劑乳化。可用介質磨對粒子直徑最多為 2,000 μm 的活性成分漿液進行濕磨以獲得平均直徑低於 3 μm 的粒子。可將水性漿液製成成品懸浮劑濃縮物（參見例如美國專利第 3,060,084 號）或進一步通過噴霧乾燥處理以形成水分散性粒劑。乾製劑通常需要進行乾磨處理，乾磨處理產生範圍在 2 至 10 μm 的平均粒徑。粉塵劑和粉劑可通過混合併通常在錘式粉碎機或流能磨中研磨而製備。顆粒劑和球劑可通過將活性材料噴在預製顆粒狀載體上或通過團聚技術來製備。參見 Browning, 「Agglomeration」, *Chemical Engineering*, 12 月 4 日, 1967, 第 147-48 頁、Perry, *Chemical Engineer's Handbook*, 第 4 版, McGraw-Hill, New York, 1963, 第 8-57 頁和後面內容，以及 PCT 公開申請案第 WO 91/13546 號。可如美國專利第 4,172,714 號中所述製備球劑。可如美國專利第 4,144,050 號、第 3,920,442 號和德國專利第 3,246,493 號中所教導的製備水分散性和水溶性顆粒劑。可如美國專利第 5,180,587 號、第 5,232,701 號和美國專利第 5,208,030 號中所教導的製備片劑。可如 GB 2,095,558 和 U.S. 3,299,566 中教導的製備膜劑。

有關製劑領域的進一步信息，請參見 T. S. Woods, 「The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture」, *Pesticide Chemistry and Bioscience*, *The*

Food-Environment Challenge, T. Brooks 和 T. R. Roberts 編輯，Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, 第 120-133 頁。還可參見美國專利第 3,235,361 號的第 6 欄第 16 行至第 7 欄第 19 行和實例 10-41；U.S. 3,309,192 的第 5 欄第 43 行至第 7 欄第 62 行和實例 8、12、15、39、41、52、53、58、132、138-140、162-164、166、167 和 169-182；U.S. 2,891,855 的第 3 欄第 66 行至第 5 欄第 17 行和實例 1-4；Klingman, *Weed Control as a Science*, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, 第 81-96 頁；Hance 等人，*Weed Control Handbook*, 第 8 版，Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989；和 *Developments in formulation technology*, PJB Publications, Richmond, UK, 2000。

在下面的實例中，所有的百分比均以重量計並且所有製劑均以常規方式製備。化合物號碼指索引表 A-B 中的化合物。在無須進一步推敲的情況下，據信所屬技術領域熟悉該項技術者使用前述說明即可利用本發明的全部內容。下列實例因此僅作為說明性而不以任何方式限制本揭露。百分計皆以重量計除非另有指明。

實例 A

高濃度濃縮物

化合物 1	98.5%
二氧化矽氣凝膠	0.5%
合成的無定形矽粉	1.0%

實例 B

可濕性粉劑

化合物 2	65.0%
十二烷基酚聚乙二醇醚	2.0%
木質素磺酸鈉	4.0%
矽鋁酸鈉	6.0%
蒙脫石 (鍛燒)	23.0%

實例 C

顆粒劑

化合物 3	10.0%
綠坡縷石顆粒劑 (低揮發性物質, 0.71/0.30 mm; 美國標準篩號 25-50 號篩)	90.0%

實例 D

水懸浮劑

化合物 4	25.0%
水合綠坡縷石	3.0%
粗木質素磺酸鈣	10.0%
磷酸二氫鈉	0.5%
水	61.5.0%

實例 E

擠出球劑

化合物 8	25.0%
無水硫酸鈉	10.0%
粗木質素磺酸鈣	5.0%
烷基萘磺酸鈉	1.0%
鈣基/鎂基膨潤土	59.0%

實例 F

微乳劑

化合物 16	5.0%
聚乙烯基吡咯烷酮-醋酸乙烯基酯共聚物	30.0%
C ₈ -C ₁₀ 烷基多苷	30.0%
單油酸甘油酯	15.0%
水	20.0%

實例 G

乳油

化合物 20	10.0%
山梨醇聚氧乙烯醚六油酸酯	20.0%
C ₆ -C ₁₀ 脂肪酸甲基酯	70.0%

通常在施用前，用水對諸如配方表中的那些的配方進行稀釋，以形成適於含水組合物。用於直接施用給植物或其部分的含水組合物（如噴霧桶使用的組合物）通常含有至少約 1 ppm 或更多（如 1 ppm 至 100 ppm）的本發明化合物。

本發明的化合物可用作植物病害控制劑。因而本發明還包括用於控制由真菌植物病原體引起的植物病害的方法，包括給要保護的植物或其部分，或給要保護的植物種子施用有效量的本發明化合物或含有所述化合物的殺真菌組合物。亦可將本發明的此態樣描述為用於保護植物或植物種子免受由真菌病原體病害的方法，其包含施用一有效量的本發明化合物（例如本文所述的組成物）於植物（或其部分）或植物種子（直接或透過植物或植物種子的環境如生長介質）上。

本發明的化合物和/或組合物可控制由擔子菌綱、子囊菌綱、卵菌綱和半知菌綱類型中的範圍廣泛真菌植物病原體引起的病害。它們可有效控制範圍廣泛的植物病害，尤其是觀賞植物、草皮、蔬菜、田間作物、穀類作物和水果作物的葉病原體。這些病原體包括：卵菌綱病原體，包括疫霉(*Phytophthora*)病害，例如致病疫黴菌(*Phytophthora infestans*)、大雄疫霉(*Phytophthora megasperma*)、寄生疫霉(*Phytophthora parasitica*)、樟疫霉(*Phytophthora cinnamomi*)和辣椒疫霉(*Phytophthora capsici*)，腐霉(*Pythium*)病害，例如瓜果腐霉(*Pythium aphanidermatum*)，以及霜霉科病害，例如葡萄生單軸霉(*Plasmopara viticola*)、斜尖狀孢子菌屬物種(*Peronospora* spp.) (包括煙草霜黴菌(*Peronospora tabacina*)和寄生霜黴菌(*Peronospora parasitica*))、假霜霉屬物種(*Pseudoperonospora* spp.) (包括古巴假霜黴菌(*Pseudoperonospora cubensis*))和萵苣盤梗霉(*Bremia lactucae*)；子囊菌(Ascomycetes)病原體，包括鏈格孢菌(*Alternaria*)病害，例如索蘭尼氏鏈格孢(*Alternaria solani*)和芸苔鏈格孢菌(*Alternaria brassicae*)，球座菌(*Guignardia*)病害，例如葡萄球座菌(*Guignardia bidwellii*)，黑星菌(*Venturia*)病害，例如蘋果黑星菌(*Venturia inaequalis*)，殼針孢(*Septoria*)病害，例如穎枯殼針孢菌(*Septoria nodorum*)和小麥殼針孢(*Septoria tritici*)，白粉菌(powdery mildew)病害，例如白粉菌屬物種(*Erysiphe* spp.) (包括禾白粉菌(*Erysiphe graminis*)和蓼白粉菌(*Erysiphe polygoni*))、葡萄鈎絲殼菌(*Uncinula*

necatur)、瓜單囊殼菌(*Sphaerotheca fuliginea*)和白叉絲單囊殼菌(*Podosphaera leucotricha*)、小麥基腐病菌(*Pseudocercospora herpotrichoides*)，葡萄孢(*Botrytis*)病害，例如灰葡萄孢菌(*Botrytis cinerea*)、褐腐菌(*Monilinia fructicola*)，核盤菌(*Sclerotinia*)病害，例如核盤菌(*Sclerotinia sclerotiorum*)、稻瘟病菌(*Magnaporthe grisea*)、葡萄擬莖點黴菌(*Phomopsis viticola*)，長蠕孢菌(*Helminthosporium*)病害，例如小麥褐斑長蠕孢霉(*Helminthosporium tritici repentis*)、圓核腔菌(*Pyrenophora teres*)，炭疽病，例如小叢殼屬物種(*Glomerella*)或刺盤孢屬物種(*Colletotrichum* spp.) (例如，禾生炭疽菌(*Colletotrichum graminicola*)和瓜類炭疽菌(*Colletotrichum orbiculare*)，以及禾頂囊殼菌(*Gaeumannomyces graminis*)；擔子菌(*Basidiomycetes*)病原體，包括由以下物種引發的銹病：柄銹菌屬物種(*Puccinia* spp.) (例如，隱匿柄銹菌(*Puccinia recondita*)、條形柄銹菌(*Puccinia striiformis*)、大麥柄銹菌(*Puccinia hordei*)、禾柄銹菌(*Puccinia graminis*)和花生柄銹菌(*Puccinia arachidis*)、咖啡駝孢銹菌(*Hemileia vastatrix*)和豆薯層銹菌(*Phakopsora pachyrhizi*)；其他病原體，包括：*Rutstroemia floccosu* (亦已知為 *Sclerotinia homoeocarpa*)；絲核菌屬物種(*Rhizoctonia* spp.) (例如立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*))；鐮刀菌(*Fusarium*)病害，例如粉紅鐮刀菌(*Fusarium roseum*)、禾谷鐮刀菌(*Fusarium graminearum*)和尖孢鐮刀菌 (*Fusarium oxysporum*)；大麗輪枝菌(*Verticillium dahliae*)病原體；

白絹菌 (*Sclerotium rolfsii*) 病原體；黑麥喙孢 (*Rynchosporium secalis*) 病原體；*Cercosporidium personatum*、花生尾孢菌 (*Cercospora arachidicola*) 和甜菜生尾孢 (*Cercospora beticola*)；以及這些病原體的其他近緣屬和種。除了它們的殺真菌活性外，該組合物或配混物還具有對抗諸如梨火疫病菌 (*Erwinia amylovora*)、野油菜黃單胞菌 (*Xanthomonas campestris*)、丁香假單胞菌 (*Pseudomonas syringae*) 和其他相關物種之類的細菌的活性。

植物病害控制通常通過在感染前或感染後，給要保護的植物的部分例如根、莖、葉、果實、種子、塊莖或鱗莖，或給待保護的植物在其中生長的基質（土壤和砂）施用有效量的本發明化合物來完成。還可以將化合物施用至種子，以保護種子和由種子發育的籽苗。還可以通過灌溉用水施用本化合物以處理植物。

這些化合物的施用比率（即殺真菌有效量）可受下列因素影響：如欲控制的植物病害、欲保護的植物品種、環境濕度與溫度，並應該由實際使用條件決定。所屬技術領域熟悉該項技術者可通過簡單實驗決定殺真菌有效量以達到必要的植物病害控制程度。當以小於約 1 g/ha 至約 5,000 g/ha 活性成分的比率處理時，葉通常可得到保護。當以每千克種子約 0.1 至約 10 g 的比率處理時，種子和籽苗通常可得到保護。

還可將本發明的化合物與一種或多種其他生物活性化合物或試劑，包括殺真菌劑、殺昆蟲劑、殺線蟲劑、殺細菌劑、殺蟎劑、除草劑、除草劑安全劑、生長調節

劑如昆蟲蛻皮抑制劑和生根刺激劑、化學絕育劑、化學傳訊物質、驅蟲劑、引誘劑、費洛蒙、誘食劑、植物營養素、其他生物活性化合物或昆蟲病原細菌、病毒或真菌混合，以形成產生更加範圍廣泛農業保護效果的多組分殺蟲劑。因而，本發明還涉及一種組合物，該組合物包含式 1 化合物（在殺真菌有效量下）和至少一種額外的生物活性化合物或試劑（在生物有效量下），並且可進一步包含至少一種表面活性劑、固體稀釋劑或液體稀釋劑。可將其他生物活性化合物或試劑配製成包含表面活性劑、固體或液體稀釋劑中的至少一者的組合物。對於本發明的混合物，可將一種或多種其他生物活性化合物或試劑與式 1 化合物一起配製，以形成預混物，或可將一種或多種其他生物活性化合物或試劑與式 1 化合物分開配製，並在施用前將製劑合併在一起（如在噴霧桶中合併），或者作為另一種選擇，將它們相繼施用。

值得注意的是除了式 1 化合物之外還包括至少一種選自由以下類型的化合物組成的組的殺真菌化合物：(1) 甲基苯并咪唑胺基甲酸酯(MBC)殺真菌劑；(2) 二甲醯亞胺類殺真菌劑；(3) 去甲基抑制劑(DMI)殺真菌劑；(4) 苯醯胺殺真菌劑；(5) 胺/嗎啉殺真菌劑；(6) 磷脂生物合成抑制劑殺真菌劑；(7) 甲醯胺殺真菌劑；(8) 羥基(2-胺基-)嘓啶殺真菌劑；(9) 苯胺基嘓啶殺真菌劑；(10) *N*- 苯基胺基甲酸酯殺真菌劑；(11) 醌外部抑制劑(QoI)殺真菌劑；(12) 苯基吡咯殺真菌劑；(13) 喹啉殺真菌劑；(14) 脂質過氧化作用抑制劑殺真菌劑；(15) 黑素生物合成抑制劑-還原酶(MBI-R)殺真菌劑；(16) 黑素生

物合成抑制劑-去水酶(MBI-D)殺真菌劑；(17)羥苯胺(hydroxyanilide)殺真菌劑；(18)角鯊烯環氧酶抑制劑殺真菌劑；(19)多氧黴素殺真菌劑；(20)苯尿殺真菌劑；(21)醌內部抑制劑(QiI)殺真菌劑；(22)苯醯胺殺真菌劑；(23)吡喃醣醛酸抗生素殺真菌劑；(24)己吡喃糖基抗生素殺真菌劑；(25)吡喃葡萄糖基抗生素：蛋白質合成殺真菌劑；(26)吡喃葡萄糖基抗生素：海藻糖酶和肌醇生物合成殺真菌劑；(27)氰基乙醯胺肟殺真菌劑；(28)胺基甲酸酯殺真菌劑；(29)氧化磷酸化解偶聯殺真菌劑；(30)有機錫殺真菌劑；(31)羧酸殺真菌劑；(32)雜芳族殺真菌劑；(33)磷酸酯殺真菌劑；(34)酞胺酸殺真菌劑；(35)苯并三嗪殺真菌劑；(36)苯-磺醯胺殺真菌劑；(37)噻嗪酮殺真菌劑；(38)噻吩-甲醯胺殺真菌劑；(39)嘧啶醯胺(pyrimidinamide)殺真菌劑；(40)羧酸醯胺(CAA)殺真菌劑；(41)四環素抗生素殺真菌劑；(42)硫胺基甲酸酯殺真菌劑；(43)苯醯胺殺真菌劑；(44)宿主植物防禦誘導型殺真菌劑(Host plant defense induction fungicides)；(45)多位點接觸活性殺真菌劑；(46)除類型(1)至(45)外的殺真菌劑；以及類型(1)至(46)的化合物的鹽。

下面對這些類型的殺真菌化合物進行了更詳細的描述。

(1) 「甲基苯并咪唑胺基甲酸酯(MBC)殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 1)可通過在微管組裝期間與 β -微管蛋白結合而抑制有絲分裂。抑制微管組裝可中斷細胞分裂、細胞和細胞結構內的轉運。

甲基苯并咪唑胺基甲酸酯殺真菌劑包括苯并咪唑和苯硫尿酯殺真菌劑。苯并咪唑包括苯菌靈、多菌靈、麥穗靈和塞菌靈。苯硫尿酯類包括硫菌靈和甲基硫菌靈。

(2) 「二甲醯亞胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 2) 據說可通過干擾 NADH 細胞色素 c 還原酶來抑制真菌中的脂質過氧化作用。例子包括乙菌利、異菌尿、腐霉利和乙烯菌核利。

(3) 「去甲基抑制劑(DMI)殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 3) 可抑制 C14-去甲基酶，其在甾醇製備中起作用。甾醇，例如麥角甾醇，是膜結構和功能所需的，使得它們是功能細胞的細胞壁發育所必需的。因而，暴露於這些殺真菌劑導致敏感真菌生長異常並最終死亡。DMI 殺真菌劑分為幾種化學類型：唑類(包括三唑和咪唑)、嘧啶類、吡嗪類和吡啶類。三唑類包括氧環唑、聯苯三唑醇、糠菌唑、環唑醇、苯醚甲環唑、烯唑醇(包括烯唑醇-M)、氟環唑、腈苯唑、氟喹唑、氟哇唑、粉唑醇、己唑醇、亞胺唑、種菌唑、葉菌唑、腈菌唑、戊菌唑、丙環唑、丙硫菌唑、矽氟唑、戊唑醇、氟醚唑、三唑酮、三唑醇、滅菌唑和烯效唑。咪唑類包括克霉唑、抑霉唑、噁咪唑、咪鮮胺、稻瘟酯和氟菌唑。嘧啶類包括氯苯嘧啶醇和氟苯嘧啶醇。吡嗪類包括嘧啶胺靈。吡啶類包括啶斑肱。生物化學研究已經顯示，所有上述殺真菌劑是如 K. H. Kuck 等人在 *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr (編輯), Gustav Fischer

Verlag: New York, 1995, 205-258 中所描述的 DMI 殺真菌劑。

(4) 「苯醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 4) 是卵菌綱真菌中的 RNA 聚合酶的特異性抑制劑。暴露於這些殺真菌劑的敏感真菌顯示出將尿甘整合進 rRNA 的能力下降。敏感真菌的生長和發育因暴露於這類殺真菌劑而受到阻止。苯醯胺殺真菌劑包括醯基丙胺酸、噁唑烷酮和丁內酯殺真菌劑。醯基丙胺酸類包括苯霜靈、苯霜靈-M、呋霜靈、甲霜靈和精甲霜靈/旋光甲霜靈。噁唑烷酮類包括噁霜靈。丁內酯類包括呋醯胺。

(5) 「胺/嗎啉殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 5) 可抑制甾醇生物合成途徑內的兩個靶位點 $\Delta^8 \rightarrow \Delta^7$ 異構酶和 Δ^{14} 還原酶。甾醇，例如麥角甾醇，是膜結構和功能所需的，使得它們是功能細胞的細胞壁發育所必需的。因而，暴露於這些殺真菌劑導致敏感真菌生長異常並最終死亡。胺/嗎啉殺真菌劑(也稱為非 DMI 甾醇生物合成抑制劑)包括嗎啉、哌啶和螺酮縮醇-胺殺真菌劑。嗎啉類包括 aldimorph、十二環嗎啉、丁苯嗎啉、十三嗎啉和垂嗎醯胺(trimorphamide)。哌啶類包括苯銹啶和哌丙靈。螺酮縮醇-胺類包括螺環菌胺。

(6) 「磷脂生物合成抑制劑殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 6) 可通過影響磷脂生物合成來抑制真菌的生長。磷脂生物合成殺真菌劑包括硫

磷酸酯類和二硫戊環類殺真菌劑。硫磷酸酯類包括敵瘟磷、異稻瘟淨和吡嘧磷。二硫戊環類包括稻瘟靈。

(7) 「甲醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 7)可通過干擾三羧酸循環(TCA 循環)中稱為琥珀酸去氫酶的關鍵酶而抑制複合物 II(琥珀酸去氫酶)真菌呼吸作用。抑制呼吸作用可阻止真菌產生 ATP，並因而可抑制生長和繁殖。甲醯胺類殺真菌劑包括苯醯胺類、呋喃甲醯胺類、氧硫雜環己二烯甲醯胺類、噻唑甲醯胺類、吡唑甲醯胺類和吡啶甲醯胺類。苯醯胺類包括麥銹靈、氟醯胺和滅銹胺。呋喃甲醯胺類包括甲呋醯胺。氧硫雜環己二烯甲醯胺類包括萎銹靈和氧化萎銹靈。噻唑甲醯胺類包括噻呋滅。吡唑甲醯胺類包括福拉比、吡噻菌胺、bixafen、isopyrazam、*N*-[2-(1*S*,2*R*)-[1,1'-二環丙基]-2-基苯基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺和 penflufen (*N*-[2-(1,3-二甲基丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺)。吡啶甲醯胺類包括啶醯菌胺。

(8) 「羥基(2-胺基-)嘧啶殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 8)可通過干擾腺苷去胺基酶而抑制核酸合成。例子包括乙嘧酚磺酸酯、甲菌定和乙嘧酚。

(9) 「苯胺基嘧啶殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 9)據說可抑制胺基酸甲硫胺酸的生物合成並破壞水解酶的分泌，該水解酶在感染期間可溶解植物細胞。例子包括嘧菌環胺、嘧菌胺和嘧霉胺。

(10) 「*N*-苄基胺基甲酸酯殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 10) 可通過與 β -微管蛋白結合併破壞微管組裝而抑制有絲分裂。抑制微管組裝可中斷細胞分裂、細胞和細胞結構內的轉運。例子包括乙霉威。

(11) 「醌外部抑制劑(QoI)殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 11) 可通過影響泛醇氧化酶而抑制真菌中的複合物 III 線粒體呼吸。泛醇的氧化在細胞色素 bc_1 複合物的「醌外部」(Q_o)位點被阻斷，該複合物位於真菌的線粒體內膜。抑制線粒體呼吸可阻止正常的真菌生長和發育。醌外部抑制劑殺真菌劑(也稱為甲氧基丙烯酸酯(strobilurin)殺真菌劑)包括甲氧基丙烯酸酯、甲氧基胺基甲酸酯、肱基乙酸酯、肱基乙醯胺、噁唑烷二酮、二氫二噁嗪、咪唑啉酮和苄基胺基甲酸酯殺真菌劑。甲氧基丙烯酸酯類包括嘧菌酯、烯肱菌酯(SYP-Z071)、啞氧菌酯與唑菌酯(pyraoxystrobin(SYP-3343))。甲氧基胺基甲酸酯類包括唑菌胺酯與唑胺菌酯(pyrametostrobin(SYP-4155))。肱基乙酸酯類包括醚菌酯和肱菌酯。肱基乙醯胺類包括醚菌胺、苯氧菌胺、肱醚菌胺、 α -[甲氧基亞胺基]-*N*-甲基-2-[[[1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基]亞胺基]甲基]苯乙醯胺和2-[[[3-(2,6-二氯苯基)-1-甲基-2-丙烯-1-亞基]胺基]氧]甲基]- α -(甲氧基亞胺基)-*N*-甲基苯乙醯胺。噁唑烷二酮類包括噁唑菌酮。二氫二噁嗪類包括氟嘧菌酯。咪唑啉酮類包括咪唑菌酮。苄基胺基甲酸酯類包括 pyribencarb。

(12) 「苯基吡咯殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 12) 可與真菌中的滲透脅迫信號轉導關聯而抑制 MAP 蛋白激酶。拌種咯和咯菌脲是該類殺真菌劑的例子。

(13) 「喹啉殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 13) 據說可通過影響早期細胞信號傳導中的 G 蛋白而抑制信號轉導。已顯示，它們可干擾引起白粉病的真菌的萌發和/或附著胞形成。苯氧喹啉與替布喹為這類殺真菌劑的例子。

(14) 「脂質過氧化作用抑制劑殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 14) 據說可抑制脂質過氧化作用，這可影響真菌的膜合成。這類殺真菌劑的成員，例如氯唑靈，還可以影響諸如呼吸作用和黑素生物合成之類的其他生物過程。脂質過氧化作用類殺真菌劑包括芳族碳和 1,2,4-噻二唑殺真菌劑。芳族碳類殺真菌劑包括聯苯、地茂散、氯硝胺、五氯硝基苯、四氯硝基苯和甲基立枯磷。1,2,4-噻二唑類殺真菌劑包括氯唑靈。

(15) 「黑素生物合成抑制劑-還原酶(MBI-R)殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 16.1) 可抑制黑素生物合成中的萘甲叉還原步驟。黑素是某些真菌進行宿主植物感染所需要的。黑素生物合成抑制劑-還原酶殺真菌劑包括異苯并呋喃酮、吡咯並喹啉酮和三唑苯并噻唑殺真菌劑。異苯并呋喃酮包括四氯苯醌。吡咯並喹啉酮包括咯喹酮。三唑苯并噻唑包括三環唑。

(16) 「黑素生物合成抑制劑-去水酶(MBI-D)殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 16.2)可抑制黑素生物合成中的小柱孢酮去水酶。黑素是某些真菌進行宿主植物感染所需要的。黑素生物合成抑制劑-去水酶殺真菌劑包括環丙烷甲醯胺、甲醯胺和丙醯胺殺真菌劑。環丙烷甲醯胺類包括加普胺。甲醯胺類包括雙氫菌胺。丙醯胺類包括禾草靈。

(17) 「羥苯胺殺真菌劑(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 17)可抑制在甾醇產生中起作用的 C4-去甲基酶。實例包括環醯菌胺。

(18) 「角鯊烯-環氧酶抑制劑殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 18)可抑制麥角甾醇生物合成途徑中的角鯊烯-環氧酶。甾醇，例如麥角甾醇是膜結構和功能所需的，使得它們是功能細胞的細胞壁發育所必需的。因而，暴露於這些殺真菌劑導致敏感真菌生長異常並最終死亡。角鯊烯-環氧酶抑制劑殺真菌劑包括硫胺基甲酸酯和烯丙胺殺真菌劑。硫胺基甲酸酯類包括稗草丹。烯丙胺類包括萘替芳和特比萘芬。

(19) 「多氧黴素殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 19)可抑制幾丁質合成酶。實例包括多氧黴素。

(20) 「苯尿殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 20)據說可影響細胞分裂。實例包括戊菌隆。

(21) 「醌內部抑制劑(QiI)殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 21)可通過影響泛醇還原

酶而抑制真菌中的複合體 III 線粒體呼吸。泛醇的還原在細胞色素 bc_1 複合物的「醌內部」(Q_i)位點被阻斷，該複合物位於真菌的線粒體內膜。抑制線粒體呼吸可阻止正常的真菌生長和發育。醌內部抑制劑殺真菌劑包括氰基咪唑和胺磺醯基三唑殺真菌劑。氰基咪唑類包括氰霜唑。胺磺醯基三唑類包括吡唑磺菌胺。

(22) 「苯醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 22) 可通過與 β -微管蛋白結合併破壞微管組裝而抑制有絲分裂。抑制微管組裝可中斷細胞分裂、細胞和細胞結構內的轉運。實例包括苯醯菌胺。

(23) 「烯醇吡喃糖醛酸抗生素殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 23) 可通過影響蛋白質生物合成來抑制真菌的生長。實例包括滅瘟素。

(24) 「己吡喃基抗生素殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 24) 可通過影響蛋白質生物合成來抑制真菌的生長。實例包括春雷黴素。

(25) 「吡喃葡萄糖基抗生素：蛋白質合成殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 25) 可通過影響蛋白質生物合成來抑制真菌的生長。實例包括鏈黴素。

(26) 「吡喃葡萄糖基抗生素：海藻糖酶和肌醇生物合成殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 26) 可抑制肌醇生物合成途徑中的海藻糖酶。實例包括有效黴素。

(27) 「氰基乙醯胺肟殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 27) 包括霜尿氰。

(28) 「胺基甲酸酯殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 28) 據認為是真菌生長的多位點抑制劑。據認為它們會干擾細胞膜內的脂肪酸合成，其隨後會破壞細胞膜滲透性。霜霉威、霜霉威鹽酸鹽、iodocarb 和胺乙威是這類殺真菌劑的例子。

(29) 「氧化磷酸化解偶聯殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 29) 可通過氧化磷酸化解偶聯來抑制真菌的呼吸。抑制呼吸可阻止正常的真菌生長和發育。這類殺真菌劑包括 2,6-二硝基苯胺類如氟啶胺、嘧啶酮脲類如嘧菌脲，以及二硝基苯基巴豆酸酯類，例如消蟎普、meptyldinocap 和樂殺蟎。

(30) 「有機錫殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 30) 可抑制氧化磷酸化途徑中的三磷酸腺苷(ATP)合成酶。實例包括醋酸三苯錫、三苯錫氣和氫氧三苯錫。

(31) 「羧酸殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 31) 可通過影響去氧核糖核酸(DNA)II型拓撲異構酶(促旋酶)來抑制真菌的生長。實例包括惡喹酸。

(32) 「雜芳族殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 32) 據認為可影響 DNA/核糖核酸(RNA)合成。雜芳族殺真菌劑包括異噁唑和異噻唑啉酮殺真菌劑。異噁唑類包括惡霉靈而異噻唑啉酮類包括辛噻酮。

(33) 「磷酸酯殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 33) 包括磷酸及其多種鹽，包括三乙磷酸鋁。

(34) 「鄰胺甲醯苯甲酸殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 34) 包括葉枯酞。

(35) 「苯并三嗪殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 35) 包括咪唑嗪。

(36) 「苯-磺醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 36) 包括磺菌胺。

(37) 「噻嗪酮殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 37) 包括噻菌酮。

(38) 「噻吩-醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 38) 據認為可影響 ATP 的產生。實例包括矽噻菌胺。

(39) 「嘧啶醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 39) 可通過影響磷脂生物合成來抑制真菌的生長並且包括氟嘧菌胺。

(40) 「羧酸醯胺(CAA)殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 40) 據認為可抑制磷脂的生物合成和細胞壁沉積。對這些過程的抑制可防止生長並導致靶真菌的死亡。羧酸醯胺殺真菌劑包括肉桂酸醯胺殺真菌劑、valinamide carbamate 和扁桃酸醯胺殺真菌劑。肉桂酸醯胺類包括烯醯嗎啉和氟嗎啉。valinamide carbamates 包括苯噻菌胺、苯噻菌胺-異丙基、丙森鋅、valifenalate 和 valiphenal。扁桃酸醯胺類包括雙炔醯菌胺、*N*-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧]-3-甲氧苯基]

乙基]-3-甲基-2-[(甲磺醯基)胺基]丁醯胺和
N-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧]-3-甲氧苯基]乙
基]-3-甲基-2-[(乙磺醯基)胺基]丁醯胺。

(41) 「四環素抗生素殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性
行動委員會(FRAC)編號 41)可通過影響複合物 1 煙醯
胺腺嘌呤二核甘酸(NADH)氧化還原酶來抑制真菌的生
長。實例包括氧四環素。

(42) 「硫胺基甲酸酯殺真菌劑(b42)」(殺真菌劑抗
藥性行動委員會(FRAC)編號 42)包括磺菌威。

(43) 「苯醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委
員會(FRAC)編號 43)可通過類血影蛋白的離域作用來
抑制真菌生長。實例包括 acylpicolide 殺真菌劑，例如
氟吡菌胺和氟吡菌醯胺(fluopyram)。

(44) 「宿主植物防禦誘導型殺真菌劑」(殺真菌劑
抗藥性行動委員會(FRAC)編號 P)可誘導宿主植物的防
禦機制。宿主植物防禦誘導型殺真菌劑包括苯并-噻二
唑、苯并異噻唑和噻二唑-甲醯胺殺真菌劑。苯并-噻二
唑類包括噻二唑素-S-甲基。苯并異噻唑類包括烯丙苯
噻唑。噻二唑-甲醯胺類包括噻醯菌胺和異噻菌胺。

(45) 「多位點接觸殺真菌劑」可通過多作用位點
抑制真菌生長並且具有接觸/預防活性。這類殺真菌劑
包括：(45.1)「銅殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員
會(FRAC)編號 M1)」、(45.2)「硫殺真菌劑」(殺真菌劑
抗藥性行動委員會(FRAC)編號 M2)」、(45.3)「二硫胺基
甲酸酯殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)
編號 M3)」、(45.4)「酞亞胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性

行動委員會(FRAC)編號 M4)、(45.5)「氯腈殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 M5)、(45.6)「磺醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 M6)、(45.7)「胍殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 M7)、(45.8)「三嗪殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 M8)和(45.9)「醌殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 M9)。「銅殺真菌劑」是含有銅的無機化合物，通常為銅(II)氧化狀態；實例包括氧氯化銅、硫酸銅和氫氧化銅，包括諸如波爾多液(三鹼基硫酸銅)之類的組合物。「硫殺真菌劑」是含有硫原子環或硫原子鏈的無機化學試劑；實例包括元素硫。「二硫胺基甲酸酯殺真菌劑」含有二硫胺基甲酸酯分子部分；實例包括：代森錳鋅、代森聯、甲基代森鋅、福美鐵、代森錳、福美雙、代森鋅和福美鋅。「酞亞胺殺真菌劑」含有酞亞胺分子部分；實例包括滅菌丹、克菌丹和敵菌丹。「氯腈殺真菌劑」含有經氯和氟基取代的芳族環；實例包括四氯二氟苯。「磺醯胺殺真菌劑」包括苯氟磺胺和甲苯氟磺胺。「胍殺真菌劑」包括十二烷基胍、雙胍辛鹽、iminooctadine albesilate 和雙胍辛乙酸鹽。「三嗪殺真菌劑」包括敵菌靈。「醌殺真菌劑」包括二氟蒽醌。

(46) 「非(1)至(45)類型殺真菌劑的殺真菌劑」包括某些其作用模式未知的殺真菌劑。這些殺真菌劑包括：(46.1)「噻唑甲醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 U5)、(46.2)「苯基-乙醯胺殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 U6)、(46.3)

「喹唑酮殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 U7)、(46.4)「二苯甲酮殺真菌劑」(殺真菌劑抗藥性行動委員會(FRAC)編號 U8)和(46.5)「三唑嘧啶殺真菌劑」。噻唑甲醯胺類包括韓樂寧。苯基-乙醯胺類包括環氟菌胺和 *N*-[[環丙基甲氧基]胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]-亞甲基]苯乙醯胺。喹唑酮類包括丙氧喹啉和 2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4*H*-1-苯并吡喃-4-酮。二苯甲酮類包括苯菌酮。三唑嘧啶殺真菌劑包括 ametoctradin。(b46)類還包括：bethoxazin、甲肫鐵銨(甲基肫酸鐵)、硝吡咯菌素、滅蟎猛、*N*-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲磺醯基)胺基]丁醯胺、*N*-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧]-3-甲氧苯基]乙基]-3-甲基-2-[(乙磺醯基)胺基]丁醯胺、2-[[2-氟-5-(三氟甲基)苯基]硫]-2-[3-(2-甲氧苯基)-2-噻唑烷亞基]乙腈、3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-3-異噁唑烷基]吡啶、4-氯苯基 *N*-[1-[[[1-(4-氯基苯基)乙基]磺醯基]甲基]丙基]胺基甲酸酯、5-氯-6-(2,4,6-三氟苯基)-7-(4-甲基哌啶-1-基)[1,2,4]三唑[1,5-*a*]嘧啶、*N*-(4-氯-2-硝基苯基)-*N*-乙基-4-甲基苯磺醯胺、*N*-[[環丙基甲氧基]胺基][6-(二氟甲氧基)-2,3-二氟苯基]亞甲基]苯乙醯胺、*N*'-[4-[4-氯-3-(三氟甲基)苯氧基]-2,5-二甲基苯基]-*N*-乙基-*N*-甲基甲脒、1-[(2-丙烯基硫)羰基]-2-(1-甲基乙基)-4-(2-甲基苯基)-5-胺基-1*H*-吡唑-3-酮和 1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑]-1-哌啶基]-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-1-yl]-乙酮。

因此，值得注意的是這樣一種混合物（即組合物），其包含式 1 化合物和至少一種選自前述(1)至(46)類殺真菌劑的殺真菌化合物。同樣值得注意的是這樣一種組合物，其包含所述混合物（為殺真菌有效量）並且還包含至少一種選自表面活性劑、固體稀釋劑和液體稀釋劑的另外的組分。特別值得注意的是這樣一種混合物（即組合物），其包含式 1 化合物和至少一種選自上面結合類型(1)至(46)所列出的具體化合物的殺真菌化合物。同樣值得特別注意的是這樣一種組合物，其包含所述混合物（為殺真菌有效量）並且還包含至少一種選自表面活性劑、固體稀釋劑和液體稀釋劑的另外的表面活性劑。

可與本發明化合物一起配製的其他生物活性化合物或試劑的例子是：殺昆蟲劑，例如阿維菌素、乙醯甲胺磷、吡蟲清、amidoflumet (S-1955)、阿滅丁、印楝素、甲基谷硫磷、聯苯菊酯、聯苯肼酯、噻嗪酮、克百威、殺螟丹、氯蟲醯胺、溴蟲腈、氟啶尿、毒死蜱、甲基毒死蜱、環蟲醯肼、塞蟲胺、cyantraniliprole (3-溴-1-(3-氟-2-啉基)-N-[4-氟基-2-甲基-6-[(甲基胺基)羰基]苯基]-1H-吡啶-5-甲醯胺)、丁氟螨酯、氟氯氰菊酯、高效氟氯氰菊酯、三氟氯氰菊酯、高效氯氟氰菊酯、氯氟菊酯、滅蠅胺、溴氯菊酯、丁啉尿、二嗪磷、狄氏劑、除蟲尿、四氟甲醚菊酯、樂果、呋蟲胺、苯蟲醚、依馬菌素、硫丹、S-氟戊菊酯、乙蟲清、苯硫威、苯氧威、甲氯菊酯、氟戊菊酯、氯蟲腈、氟啶蟲醯胺、氯蟲醯胺、氟氯戊菊酯、氟胺氯菊酯、flufenerim (UR-50701)、氯蟲尿、fonophos、氯蟲醯肼、氯鈴尿、氯蟻脗、吡蟲啉、

節蟲威、異柳磷、虱蟎尿、馬拉硫磷、氰氟蟲脞、四聚乙醛、甲胺磷、殺撲磷、滅多威、烯蟲酯、甲氧滴滴涕、甲氧苄氟菊酯、倍脈心肱、久效磷、甲氧蟲醯肼、菸鹼、烯啶蟲胺、硝蟲噻嗪、雙苯氟尿、多氟尿(XDE-007)、草胺醯、對硫磷、甲基對硫磷、氯菊酯、甲拌磷、伏殺硫磷、亞胺硫磷、磷胺、抗蚜威、丙溴磷、丙氟菊酯、吡蚜酮、pyrafluprole、除蟲菊酯、啶蟲丙醚、pyrifluquinazon、pyriprole、蚊蠅醚、魚藤酮、魚尾汀鹼、spinetoram、艾克敵、螺蟎酯、螺甲蟎酯(BSN 2060)、螺蟲乙酯、硫丙磷、抑蟲肼、氟苯尿、七氟菊酯、特丁硫磷、殺蟲威、噻蟲啉、噻蟲嗪、硫雙威、殺蟲雙、啞蟲醯胺、四溴菊酯、啞蚜威、敵百蟲和殺鈴尿；和生物製劑，包括昆蟲病原細菌，例如蘇芸金桿菌(*Bacillus thuringiensis*)亞種亞莎華(*aizawai*)，蘇芸金桿菌亞種庫斯塔克(*kurstaki*)，以及膠囊化的蘇芸金桿菌的 δ -內毒素(例如，Cellcap、MPV、MPVII)；昆蟲病原真菌，例如綠僵菌；和昆蟲病原病毒，包括桿狀病毒、核型多角體病毒(NPV)如 HzNPV、AfNPV；以及顆粒症病毒(GV)如 CpGV。

本發明的化合物及其組合物可以施用給經遺傳轉化而表達對無脊椎害蟲有毒性的蛋白質(例如蘇芸金桿菌(*Bacillus thuringiensis*) δ -內毒素)的植物。外源施用的本發明殺真菌化合物的作用可因表達毒素蛋白而增效。

有關農業保護劑(即殺昆蟲劑、殺真菌劑、殺線蟲劑、殺蟎劑、除草劑和生物製劑)的一般參考文獻包括：*The Pesticide Manual*, 第 13 版，C. D. S. Tomlin (編

輯)，British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2003 和 *The BioPesticide Manual*, 第 2 版，L. G. Copping (編輯)，British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, U.K., 2001。

在一些情況下，本發明化合物與其他生物活性（特別是殺真菌）化合物或試劑（即活性成分）的組合可產生增強（即協同）效應。減少釋放進環境中的活性成分的量，同時確保有效的蟲害控制一直都是所希望的。當殺真菌活性成分的協同作用在可產生農藝學上令人滿意的真菌控制水平的施用率下發生時，這樣的組合對於減小作物生產成本和減小環境負荷而言是有利的。

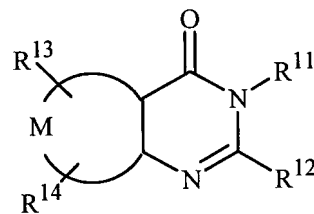
值得注意的是式 1 化合物與至少一種其他殺真菌活性成分的組合。值得特別注意的是這樣的組合，在該組合中其他殺真菌活性成分具有不同於式 1 化合物的作用位點。在一些情況下，對於耐藥性管理而言，與至少一種具有相似控制譜但具有不同作用位點的其他殺真菌活性成分的組合將是特別有利的。因此，本發明的組合物還可以包含生物有效量的至少一種另外的殺真菌活性成分，其具有相似控制譜但具有不同的作用位點。

值得特別注意的是這樣的組合物，除了式 1 化合物外，其還包含至少一種選自如下的化合物：
(1)alkylenebis(二硫胺基甲酸酯)殺真菌劑；(2)霜尿氫；
(3)苯醯胺殺真菌劑；(4)嘧啶酮殺真菌劑；(5)四氯二氫苯；(6)作用於真菌線粒體呼吸電子傳遞位點的複合物 II 的甲醯胺類；(7)苯氧喹啉；(8)苯菌酮；(9)環氟菌胺；

(10)嘍菌環胺；(11)銅類化合物；(12)酞亞胺殺真菌劑；(13)三乙膦酸鋁；(14)苯并咪唑殺真菌劑；(15)氟霜唑；(16)氟啶胺；(17)丙森鋅；(18)霜霉威；(19)有效黴素；(20)二氯苯基二甲醯亞胺殺真菌劑；(21)苯醯菌胺；(22)氟吡菌胺；(23)雙炔醯菌胺；(24)作用於磷脂生物合成和細胞壁沉積的羧酸醯胺；(25)烯醯嗎啉；(26)非-DMI甾醇生物合成抑制劑；(27)甾醇生物合成中的去甲基酶的抑制劑；(28) bc_1 複合物殺真菌劑；以及化合物(1)至(28)的鹽。

下面對殺真菌化合物類型進行了更詳細的描述。

嘍啶酮殺真菌劑（第(4)組）包括式 A1 化合物：



A1

其中 M 形成稠合的苯基、噻吩或吡啶環； R^{11} 為 C_1-C_6 烷基； R^{12} 為 C_1-C_6 烷基或 C_1-C_6 烷氧基； R^{13} 為鹵素；而 R^{14} 為氫或鹵素。

嘍啶酮殺真菌劑在 PCT 專利公開申請案第 WO 94/26722 號和美國專利第 6,066,638、6,245,770、6,262,058 和 6,277,858 號中有描述。值得注意的是選自下列組的嘍啶酮殺真菌劑：6-溴-3-丙基-2-丙氧基-4(3H)-喹唑酮、6,8-二碘-3-丙基-2-丙氧基-4(3H)-喹唑

酮、6-碘-3-丙基-2-丙氧基-4(3*H*)-喹唑酮（丙氧喹啉）、6-氯-2-丙氧基-3-丙基噻吩並[2,3-*d*]嘧啶-4(3*H*)-酮、6-溴-2-丙氧基-3-丙基噻吩並[2,3-*d*]嘧啶-4(3*H*)-酮、7-溴-2-丙氧基-3-丙基噻吩並[3,2-*d*]嘧啶-4(3*H*)-酮、6-溴-2-丙氧基-3-丙基吡啶並[2,3-*d*]嘧啶-4(3*H*)-酮、6,7-二溴-2-丙氧基-3-丙基噻吩並[3,2-*d*]嘧啶-4(3*H*)-酮和 3-(環丙基甲基)-6-碘-2-(丙硫基)吡啶並[2,3-*d*]嘧啶-4(3*H*)-酮。

甾醇生物合成抑制劑（第(27)組）可通過抑制甾醇生物合成途徑中的酶來控制真菌。去甲基酶-抑制性殺真菌劑在真菌的甾醇生物合成途徑中具有通用的作用位點，涉及在羊毛甾醇或 24-亞甲基聚二水羊毛甾醇（在真菌中其是甾醇的前體）的位置 14 處抑制去甲基作用。作用於該位點的化合物常常稱為去甲基酶抑制劑、DMI 殺真菌劑或 DMI。在生化文獻中有時會將去甲基酶用其他名稱表示，包括細胞色素 P-450 (14DM)。去甲基酶（例如）在 *J. Biol. Chem.* 1992, 267, 13175-79 和其中引用的參考文獻中有描述。DMI 殺真菌劑分為幾種化學類型：唑類（包括三唑和咪唑）、嘧啶類、哌嗪類和吡啶類。三唑類包括氧環唑、糠菌唑、環唑醇、苯醚甲環唑、烯唑醇（包括烯唑醇-M）、氟環唑、乙環唑、腈苯唑、氟喹唑、氟哇唑、粉唑醇、己唑醇、亞胺唑、種菌唑、葉菌唑、腈菌唑、戊菌唑、丙環唑、丙硫菌唑、喹唑(quinconazole)、矽氟唑、戊唑醇、氟醚唑、三唑酮、三唑醇、滅菌唑和烯效唑。咪唑類包括克霉唑、益康唑、抑霉唑、異康唑、咪康唑、噁咪唑、咪鮮胺和氟菌唑。嘧啶類包括氟苯嘧啶醇、氟苯嘧啶醇和嘧菌醇。哌嗪類

包括噁胺靈。吡啶類包括丁硫啶和啶斑肱。生物化學研究已經顯示，所有上述殺真菌劑是如 K. H. Kuck 等人在 *Modern Selective Fungicides - Properties, Applications and Mechanisms of Action*, H. Lyr(編輯), Gustav Fischer Verlag: New York, 1995, 205-258 中所描述的 DMI 殺真菌劑。

bc_1 複合物殺真菌劑(第 28 組)具有抑制線粒體呼吸鏈中的 bc_1 複合物的殺真菌作用模式。在生化文獻中有時將 bc_1 複合物用其他名稱來表示，包括電子傳遞鏈的複合物 III，和輔酶 Q-H₂:細胞色素 *c* 氧化還原酶。該複合物獨特地由酶學委員會編碼 EC1.10.2.2 確定。 bc_1 複合物在(例如) *J. Biol. Chem.* **1989**, 264, 14543-48; *Methods Enzymol.* **1986**, 126, 253-71 和其中引用的參考文獻中有描述。Strobilurin 殺真菌劑如嘧菌酯、醚菌胺、烯肱菌酯(SYP-Z071)、氟嘧菌酯、醚菌酯、苯氧菌胺、肱醚菌胺、啶氧菌酯、唑菌胺酯、唑胺菌酯、唑菌酯和肱菌酯已知具有這種作用模式(H. Sauter 等人, *Angew. Chem. Int. Ed.* **1999**, 38, 1328-1349)。抑制線粒體呼吸鏈中的 bc_1 複合物的其他殺真菌化合物包括噁唑菌酮和咪唑菌酮。

Alkylenebis(二硫胺基甲酸酯)(第(1)組)包括諸如代森錳鋅、代森錳、甲基代森鋅和代森鋅之類的化合物。苯基醯胺類(第(3)組)包括諸如甲霜靈、苯霜靈、呋霜靈和噁霜靈之類的化合物。甲醯胺類(第(6)組)包括諸如啶醯菌胺、萎銹靈、甲呋醯胺、氟醯胺、福拉比、滅銹胺、氧化萎銹靈、噁呋滅、吡噻菌胺和 *N*-[2-(1,3-

二甲基丁基)苯基]-5-氟-1,3-二甲基-1*H*-吡唑-4-甲醯胺 (PCT 專利公開申請案第 WO 2003/010149) 之類的化合物，並且已知可通過破壞呼吸電子傳遞鏈中的複合物 II (琥珀酸酯去氫酶) 來抑制線粒體功能。銅類化合物 (第(11)組) 包括諸如氧氯化銅、硫酸銅和氫氧化銅之類的化合物，包括諸如波爾多液 (三鹼基硫酸銅) 之類的組合物。酞亞胺 (第(12)組) 包括諸如滅菌丹和克菌丹之類的化合物。苯并咪唑殺真菌劑 (第(14)組) 包括苯菌靈和多菌靈。二氯苯基二甲醯亞胺殺真菌劑 (第(20)組) 包括乙菌利、菌核利、異菌尿、isovaledione、myclozolin、腐霉利和乙烯菌核利。

非-DMI 甾醇生物合成抑制劑 (第(26)組) 包括嗎啉和哌啶殺真菌劑。嗎啉類和哌啶類是這樣的甾醇生物合成抑制劑，據顯示其是在由 DMI 甾醇生物合成抑制劑 (第(27)組) 實現抑制後的點進行甾醇生物合成途徑中的抑制步驟。嗎啉類包括 aldimorph、十二環嗎啉、丁苯嗎啉、十三嗎啉和垂嗎醯胺。哌啶類包括苯銹啶。

還為眾人所知的是式 1 化合物與嘧菌酯、醚菌酯、肱菌酯、唑菌胺酯、啶氧菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺/fenominostrobin、多菌靈、百菌清、苯氧喹啉、苯菌酮、環氟菌胺、苯銹啶、丁苯嗎啉、糠菌唑、環唑醇、苯醚甲環唑、氟環唑、腈苯唑、氟哇唑、己唑醇、種菌唑、葉菌唑、戊菌唑、丙環唑、丙氧喹啉、丙硫菌唑、戊唑醇、滅菌唑、噁唑菌酮、咪鮮胺、吡噻菌胺和啶醯菌胺 (nicobifen) 的組合。

對於更好控制由真菌植物病原體引起的植物病害（如使用率較低或可控制的植物病原體範圍更廣）或抗藥性管理較佳的是本發明化合物與選自如下組的殺菌劑的混合物：嘧菌酯、醚菌酯、肟菌酯、唑菌胺酯、啞氧菌酯、醚菌胺、苯氧菌胺/fenominostrobin、苯氧喹啉、苯菌酮、環氟菌胺、苯銹啞、丁苯嗎啉、環唑醇、氟環唑、氟哇唑、葉菌唑、丙環唑、丙氧喹啉、丙硫菌唑、戊唑醇、滅菌唑、噁唑菌酮和吡噻菌胺。

尤其較佳的混合物（化合物號指索引表 A-B 中的化合物）選自如下組：化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與 ametoctradin，化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與嘧菌酯的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與 bixafen 的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與啞醯菌胺；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與環氟菌胺的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物

18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與環唑醇的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與噻菌胺的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與氟環唑的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與凡殺同的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與苯銹啉的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與丁苯嗎啉的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與氟吡菌醯胺的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與丁苯嗎啉的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與氟哇

唑的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與丁苯嗎啉的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與 flutianil 的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與丁苯嗎啉的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與 isopyrazam 的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與異噻菌胺的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與醚菌酯的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與雙炔醯菌胺的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與 meptyldinocap 的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、

化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與葉菌唑的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與苯氧菌胺/fenominostrobin 的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與苯菌酮的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與 penflufen 的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與吡噻菌胺的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與啶氧菌酯的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與丙環唑的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與丙氧喹啉的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、

化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與丙硫菌唑的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與唑菌胺酯的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與唑菌酯的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與 pyribencarb 的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與苯氧喹啉的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與戊唑醇的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與替布啶的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或

化合物 44 與脲菌酯的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與滅菌唑的組合；化合物 1、化合物 2、化合物 3、化合物 4、化合物 8、化合物 16、化合物 18、化合物 20、化合物 29、化合物 35、化合物 42、化合物 43 或化合物 44 與 valifenalate 的組合。

對於使用一或多個各式其他生物有效化合物或劑（即混合配偶體）的實施例而言，這些各式混合配偶體（加總）與式 1 化合物之重量比例典型為約 1:3000 至約 3000:1 間。值得注意的重量比例為約 1:300 至約 300:1 間（例如約 1:3000 至約 3000:1 間的比例）。本領域技術人員可通過簡單的實驗容易地確定達到所需植物病害生物活性範圍所必要的活性成分生物有效量。將會明白的是，包括這些額外組分可擴展病害控制範圍而超過單獨使用式 1 化合物所能控制的範圍。再者，某些殺真菌劑的組合可展現大於加成性（即協同作用）的效果，而提供具有商業重要性的植物病害控制水準。

本發明混合物、組成物與方法的說明如表 A1 所示，其揭露式 1 化合物與其他生物活性化合物的混合物。特別是，揭露化合物 4（見索引表 A 的化合物描述）與列於行頭「混合配偶體」下化合物的混合物，以及兩種列於行頭「比例說明」下的特定重量比例。例如，第一列揭露化合物 4 與阿拉酸式苯-S-甲基的混合物，化合物 4 與阿拉酸式苯-S-甲基的重量比例為 1:3 或 3:1。

表 A1

化合物	混合配偶體	比例說明(*)	
4	阿拉酸式苯-S-甲基	1:3	3:1
4	aldimorph	1:50	1:7
4	吲唑磺菌胺	1:10	1:2
4	敵菌靈	1:150	1:23
4	氧環唑	1:15	1:2
4	嘧菌酯	1:20	1:3
4	苯霜靈	1:10	1:2
4	苯霜靈-M	1:7	2:1
4	麥銹靈	1:30	1:4
4	苯菌靈	1:75	1:9
4	苯噻菌胺	1:3	2:1
4	苯噻菌胺-異丙基	1:3	2:1
4	bethoxazin	1:100	1:12
4	樂殺蟎	1:100	1:12
4	聯苯基	1:100	1:12
4	聯苯三唑醇	1:25	1:5
4	bixafen	1:15	1:3
4	滅瘟素	1:1	5:1
4	波爾多液(三鹼基硫酸銅)	1:300	1:34
4	啞醯菌胺	1:30	1:4
4	糠菌唑	1:20	1:3
4	乙嘧吩磺酸酯	1:2	5:1
4	敵菌丹	1:100	1:12
4	克菌丹	1:100	1:12
4	多菌靈	1:75	1:9
4	萎銹靈	1:30	1:4
4	加普胺	1:20	1:3
4	地茂散	1:700	1:89
4	四氯二氟苯	1:100	1:12
4	乙菌利	1:75	1:12
4	克霉唑	1:20	1:3
4	氧氯化銅	1:400	1:45
4	銅鹽如硫酸銅和氫氧化銅	1:50	1:6
4	氟霜唑	1:7	1:2
4	環氟菌胺	1:2	4:1
4	霜尿氟	1:12	1:2
4	環唑醇	1:8	1:2
4	嘧菌環胺	1:30	1:4

化合物	混合配偶體	比例說明(*)	
4	苯氣磺胺	1:100	1:12
4	雙氯氟菌胺	1:100	1:12
4	噻菌酮	1:25	1:3
4	氯硝胺	1:100	1:12
4	乙霉威	1:50	1:6
4	苯醚甲環唑	1:5	2:1
4	氟嘧菌胺	1:100	1:12
4	甲菌定	1:2	5:1
4	烯醯嗎啉	1:20	1:4
4	醚菌胺	1:15	1:2
4	烯唑醇	1:6	2:1
4	烯唑醇 M	1:5	2:1
4	消螨普	1:15	1:3
4	二氯蔥醌	1:33	1:6
4	十二環嗎啉	1:50	1:7
4	十二烷基胍	1:70	1:12
4	敵瘟磷	1:25	1:3
4	烯肱菌酯	1:15	1:2
4	氟環唑	1:8	1:1
4	韓樂寧	1:15	1:3
4	氯唑靈	1:50	1:6
4	噁唑菌酮	1:15	1:2
4	咪唑菌酮	1:13	1:2
4	氯苯嘧啶醇	1:2	4:1
4	腈苯唑	1:5	2:1
4	甲呋醯胺	1:30	1:4
4	環醯菌胺	1:66	1:12
4	禾草靈	1:100	1:12
4	拌種咯	1:100	1:12
4	苯銹啞	1:50	1:7
4	丁苯嗎啉	1:50	1:7
4	醋酸三苯錫	1:20	1:3
4	三苯錫氣	1:20	1:3
4	氫氧三苯錫	1:20	1:3
4	福美鐵	1:200	1:23
4	嘧菌胺	1:50	1:6
4	氟啞胺	1:25	1:5
4	咯菌腈	1:15	1:2
4	氟醯菌胺	1:20	1:4

化合物	混合配偶體	比例說明(*)	
4	氟嗎啉	1:20	1:3
4	氟吡菌胺	1:7	1:2
4	氟吡菌醯胺	1:20	1:3
4	氟氣菌核利	1:250	1:28
4	氟密菌酯	1:10	1:2
4	氟喹唑	1:10	1:2
4	氟哇唑	1:20	1:3
4	磺菌胺	1:100	1:12
4	flutianil	1:10	1:2
4	氟醯胺	1:30	1:4
4	粉唑醇	1:10	1:2
4	滅菌丹	1:100	1:12
4	三乙膦酸鋁	1:200	1:34
4	麥穗靈	1:75	1:9
4	呋霜靈	1:10	1:2
4	福拉比	1:100	1:12
4	雙胍辛鹽	1:100	1:12
4	己唑醇	1:12	1:2
4	惡霉靈	1:500	1:56
4	抑霉唑	1:12	1:2
4	亞胺唑	1:12	1:2
4	iodocarb	1:100	1:12
4	種菌唑	1:12	1:2
4	異稻瘟淨	1:100	1:12
4	異菌尿	1:100	1:12
4	丙森鋅	1:15	1:3
4	稻瘟靈	1:300	1:34
4	isopyrazam	1:15	1:3
4	異噻菌胺	1:15	1:3
4	春雷黴素	1:2	4:1
4	醚菌酯	1:15	1:2
4	代森錳鋅	1:150	1:17
4	雙炔醯菌	1:13	1:2
4	代森錳鋅	1:150	1:17
4	密菌胺	1:40	1:7
4	滅銹胺	1:10	1:2
4	meptyldinocap	1:15	1:3
4	苯霜靈	1:10	1:2
4	苯霜靈-M	1:10	1:2

化合物	混合配偶體	比例說明(*)	
4	葉菌唑	1:6	1:2
4	磺菌威	1:100	1:12
4	代森聯	1:100	1:12
4	苯氧菌胺	1:20	1:3
4	苯菌酮	1:13	1:2
4	腈菌唑	1:7	2:1
4	萘替芳	1:100	1:12
4	甲肫鐵銨 (甲基肫酸鐵)	1:100	1:12
4	氟苯嘧啶醇	1:20	1:3
4	辛噻酮	1:100	1:12
4	呋醯胺	1:10	1:2
4	肱醚菌胺	1:20	1:3
4	噁霜靈	1:10	1:2
4	惡唑酸	1:50	1:6
4	噁咪唑	1:12	1:2
4	氧化萎銹靈	1:30	1:4
4	氧四環素	1:25	1:3
4	稻瘟酯	1:100	1:12
4	戊菌唑	1:2	3:1
4	戊菌隆	1:75	1:12
4	吡噻菌胺	1:15	1:3
4	磷酸及鹽	1:100	1:12
4	2- 萘并呋喃酮	1:100	1:12
4	啉氧菌酯	1:12	1:2
4	啉丙靈	1:20	1:3
4	多氧黴素	1:25	1:3
4	烯丙苯噻唑	1:20	1:3
4	咪鮮胺	1:50	1:6
4	腐霉利	1:75	1:9
4	霜霉威	1:66	1:12
4	霜霉威-氯化氫	1:66	1:12
4	丙環唑	1:10	1:2
4	甲基代森鋅	1:75	1:12
4	丙氧喹啉	1:5	2:1
4	丙硫菌唑	1:12	1:2
4	唑菌胺酯	1:15	1:2
4	吡嘧磷	1:100	1:12
4	pyribencarb	1:30	1:4
4	啉斑肱	1:20	1:3

化合物	混合配偶體	比例說明(*)	
4	密霉胺	1:25	1:4
4	咯嗪酮	1:20	1:3
4	硝吡咯菌素	1:100	1:12
4	滅蟎猛	1:100	1:12
4	苯氧嗪啉	1:7	1:2
4	五氯硝基苯	1:100	1:12
4	矽噻菌胺	1:15	1:2
4	矽氟唑	1:12	1:2
4	螺環菌胺	1:37	1:6
4	鏈黴素	1:25	1:3
4	硫	1:500	1:56
4	戊唑醇	1:12	1:2
4	克枯爛	1:100	1:12
4	四氯硝基苯	1:100	1:12
4	特比萘芬	1:100	1:12
4	氟醚唑	1:12	1:2
4	塞菌靈	1:75	1:9
4	噻呋滅	1:20	1:3
4	苯硫尿酯	1:75	1:9
4	甲基硫菌靈	1:75	1:9
4	福美雙	1:250	1:28
4	噻醯菌胺	1:15	1:3
4	甲基立枯磷	1:250	1:28
4	甲苯氟磺胺	1:100	1:12
4	三唑酮	1:12	1:2
4	三唑醇	1:12	1:2
4	咪唑嗪	1:100	1:12
4	三環唑	1:20	1:3
4	十三嗎啉	1:50	1:7
4	肱菌酯	1:13	1:2
4	三環唑	1:20	1:3
4	噻胺靈	1:20	1:3
4	垂嗎醯胺	1:50	1:6
4	滅菌唑	1:12	1:2
4	烯效唑	1:12	1:2
4	有效黴素	1:20	1:3
4	valiphenal	1:13	1:2
4	乙烯菌核利	1:100	1:12
4	代森鋅	1:250	1:28

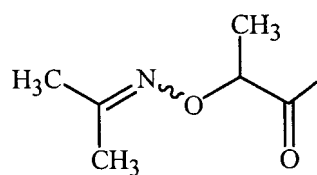
化合物	混合配偶體	比例說明(*)	
4	福美鋅	1:250	1:28
4	苯醯菌胺	1:13	1:2
4	3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-3-異噁唑烷基]吡啶	1:20	1:3
4	4-氯苯基 <i>N</i> -[1-[[[1-(4-氯基苯基)乙基]磺醯基]甲基]丙基]胺基甲酸酯	1:13	1:2
4	5-氯-6-(2,4,6-三氯苯基)-7-(4-甲基哌啶-1-基)[1,2,4]三唑[1,5- <i>a</i>]嘧啶	1:10	1:2
4	α -[甲氧基亞胺基]- <i>N</i> -甲基-2-[[[1-[3-(三氯甲基)苯基]乙氧基]亞胺基]甲基]苯乙醯胺	1:20	1:3
4	<i>N</i> -(4-氯-2-硝基苯基)- <i>N</i> -乙基-4-甲基苯磺醯胺	1:20	1:3
4	<i>N</i> -[[環丙基甲氧基]胺基][6-(二氯甲氧基)-2,3-二氯苯基]-亞甲基]苯乙醯胺	1:2	4:1
4	<i>N</i> -[2-(1,3-二甲基丁基)苯基]-5-氯-1,3-二甲基-1 <i>H</i> -吡唑-4-甲醯胺	1:15	1:3
4	<i>N</i> -[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧]-3-甲氧基]乙基]-3-甲基-2-[(乙磺醯基)胺基]丁醯胺	1:13	1:2
4	<i>N</i> -[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔-1-基]氧]-3-甲氧基]乙基]-3-甲基-2-[(甲磺醯基)胺基]丁醯胺	1:13	1:2
4	<i>N</i> -[4-[4-氯-3-(三氯甲基)苯氧基]-2,5-二甲基苯基]- <i>N</i> -乙基- <i>N</i> -甲基甲脒	1:20	1:3

本揭露亦包括表 A2 至 A7，各表如同表 A1 建構除了行頭「化合物」下的條目用下列所示的化合物代號取代（見索引表 A-B 的化合物描述）。因此，表 A2 與表 A1 相同，除了行頭「化合物」下的各「4」條目用「2」取代。表 A3 至 A7 以類似表 A2 的方式建構。

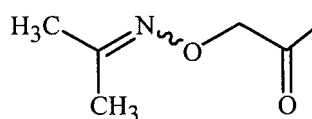
表號	化合物
A2	2
A3	18
A4	20
A5	42
A6	43
A7	44

下面的測試論證了本發明化合物對具體病原體的控制功效。然而，由所述化合物提供的病原體控制保護不限於這些物種。對於化合物描述，請參見索引表 A-B。對於 ^1H NMR 資料，請參見表 C。在索引表 A-B 中，縮寫「化合物 No.」指「化合物」，縮寫「Ex.」代表「實例」並且其後面的數字指明化合物是在哪個實例中製備。AP⁺ (M+1) 列所報告的數值為將 H⁺ (分子量 1) 加至具有最高同位素豐度 (即 M) 分子所形成的觀測分子離子的分子量。含有一或多個較高原子量但具有較低豐度的同位素 (如 ^{37}C 、 ^{81}C) 的分子離子其存在並未報告。所報告的 M+1 峰是利用大氣壓化學電離 (AP⁺) 通過質譜來觀察。在表 A-B 上方的馬庫斯結構所示的 L 取代基代表 (R¹)(R²)=N~AC(R³)(R⁴)C(=W)- 部分，其示出於本發明概述中的式 1。在表 A-B 中行頭「L」下為選自 L-1 至 L-30 的條目。例如，用於化合物代號 1 的 L 為 L-1，用於化合物代號 7 的 L 為 L-2，而用於化合物代號 12 的 L 為 L-8。L-1 至 L-30 的結構如下所示。

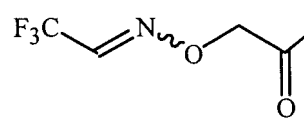
向右伸出的鍵連接至吡啶的氮原子上，如在表 A 與 B 上方的馬庫斯結構所示。



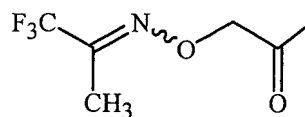
L-1



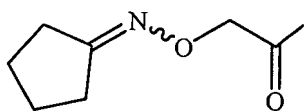
L-2



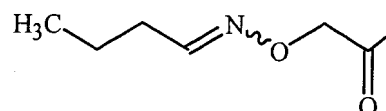
L-3



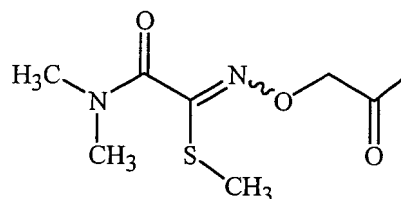
L-4



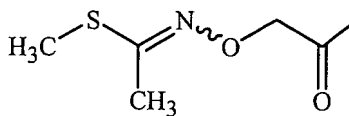
L-5



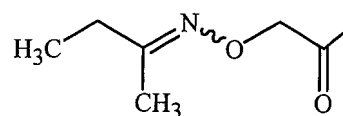
L-6



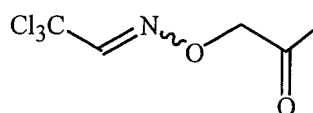
L-7



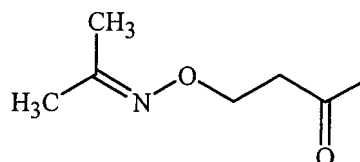
L-8



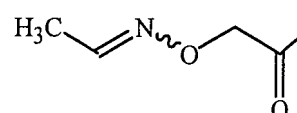
L-9



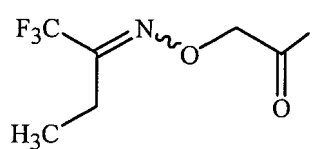
L-10



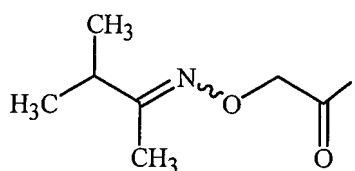
L-11



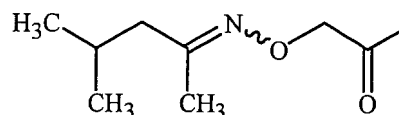
L-12



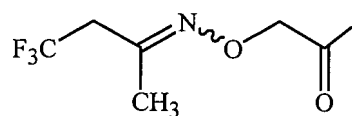
L-13



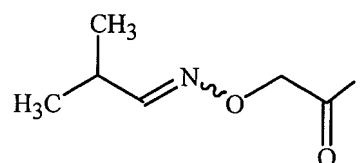
L-14



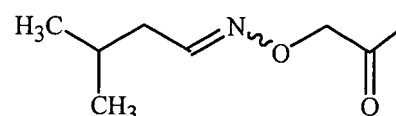
L-15



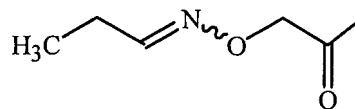
L-16



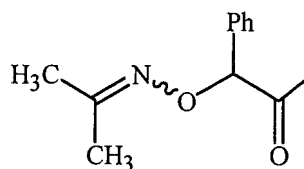
L-17



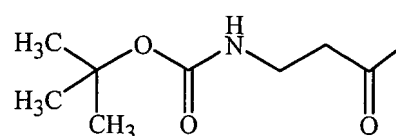
L-18



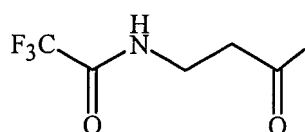
L-19



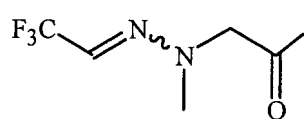
L-20



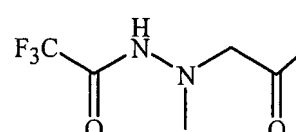
L-21



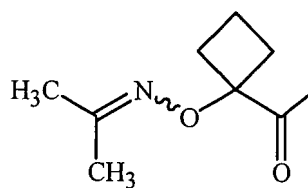
L-22



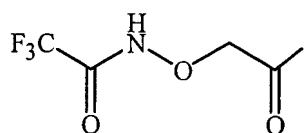
L-23



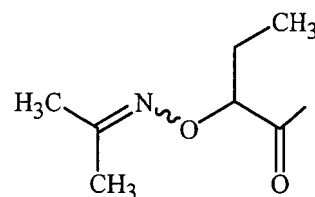
L-24



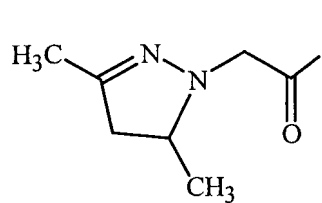
L-25



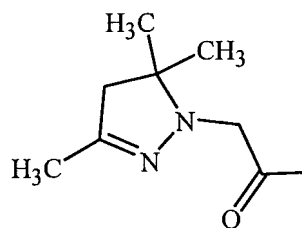
L-26



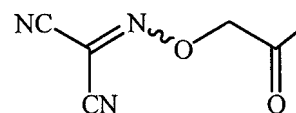
L-27



L-28

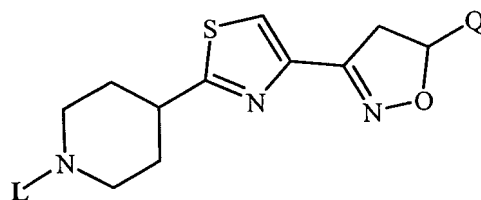


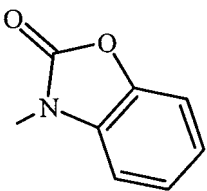
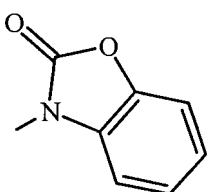
L-29

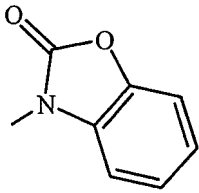
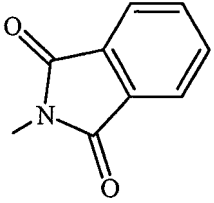
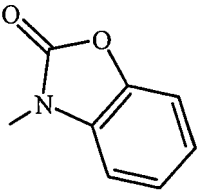


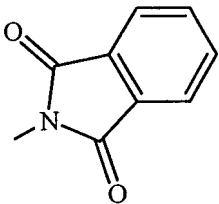
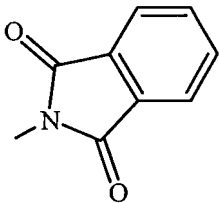
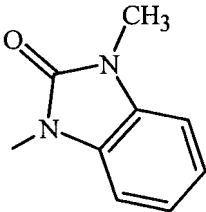
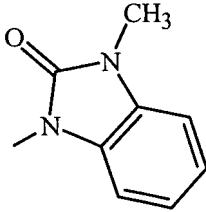
L-30

索引表 A



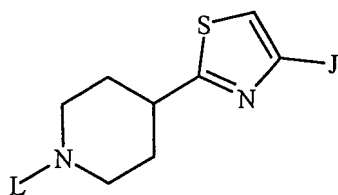
化合物 No.	L	Q	AP ⁺ (M+1)
1	L-1	2,6-二氟苯基	447
2	L-2	2,6-二氟苯基	463
3	L-3	2,6-二氟苯基	503
4	L-4	2,6-二氟苯基	517
5	L-5	2,6-二氟苯基	489
6	L-2	苯基	427
7	L-2	2-氟苯基	445
8	L-2		484
9	L-1		498
10	L-6	2,6-二氟苯基	477
11	L-7	2,6-二氟苯基	552
12	L-8	2,6-二氟苯基	495
14	L-2	2-甲基苯基	441
16	L-9	2,6-二氟苯基	477
17	L-10	2,6-二氟苯基	551

化合物 No.	L	Q	AP ⁺ (M+1)
18	L-3		524
19	L-3		536
20	L-3	2-氟基苯基	492
21	L-11	2,6-二氟苯基	477
22	L-12	2,6-二氟苯基	449
23	L-13	2,6-二氟苯基	532
24	L-14	2,6-二氟苯基	492
25	L-15	2,6-二氟苯基	506
26	L-16	2,6-二氟苯基	531
27	L-17	2,6-二氟苯基	478
28	L-18	2,6-二氟苯基	491
30	L-19	2,6-二氟苯基	463
32	L-20	2,6-二氟苯基	*
33	L-21	2,6-二氟苯基	521
34	L-22	2,6-二氟苯基	517
35	L-23	2,6-二氟苯基	516
36	L-24	2,6-二氟苯基	532
37	L-25	2,6-二氟苯基	503
38	L-26	2,6-二氟苯基	519
39	L-27	2,6-二氟苯基	491
40	L-28	2,6-二氟苯基	488
41	L-2	2-氟基苯基	452
42	L-4	2-氟基苯基	506
43	L-4		538

化合物 No.	L	Q	AP ⁺ (M+1)
44	L-4		550
45	L-2		496
46	L-29	2,6-二氟苯基	502
48	L-3		537
49	L-4		551
51	L-30	2,6-二氟苯基	485

¹H NMR 資料見表 C。

索引表 B



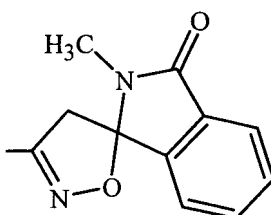
J 為藉由向左伸出的鍵連接至上述式之噻唑環。

化合物

No.	L	J	AP ⁺ (M+1)
13	L-2		453
15	L-2		443
29	L-3		493
31	L-3		483
47	L-3		522

J 為藉由向左伸出的鍵連接至上述式之噻唑環。

化合物

No.	L	J	AP ⁺ (M+1)
50	L-4		536

[註 1]: R-異構物。

索引表 C

化合物 No. ¹H NMR 數據 (CDCl₃ 溶液, 除非另有說明)^a

32 δ 7.60 (d, 1H), 7.43 (d, 2H), 7.27–7.36–7.27 (m, 4H), 6.89 (t, 2H), 6.04 (t, 1H), 5.90 (d, 1H), 4.65 (t, 1H), 4.02–4.07–4.02 (m, 2H), 3.75 (t, 1H), 3.54–3.61–3.54 (m, 1H), 3.19 (br s, 1H), 3.02 (q, 1H), 2.81 (q, 1H), 2.12 (d, 1H), 1.96 (s, 3H), 1.88 (s, 3H), 1.52–1.80–1.52 (m, 2H).

a ¹H NMR 數據是以相對於四甲基矽烷向低場偏移的 ppm 計。耦合通過(s)-單峰、(d)-雙重峰、(t)-三重峰、(m)-多重峰、(q)-四重峰以及 (br s)-寬單峰指明。

本發明的生物學實例

製備用於測試 A-B2 的試驗懸浮劑的一般方案：首先將試驗化合物以等於最終體積的 3% 的量溶解於丙酮中，然後將其以所需濃度（單位為 ppm）懸浮於含有 250 ppm 表面活性劑 Trem® 014（多元醇酯）的丙酮和純化水（50/50 體積混合物）中。然後將所得試驗懸浮劑用於測試 A-B2。在試驗植物上噴灑 200 ppm 試驗懸浮劑至流失點等同於 800 g/ha 的比率。

測試 A

將葡萄籽苗用葡萄生單軸霉的孢子懸浮液（葡萄霜霉病致病原）進行接種，並在 20 °C 下於飽和大氣中孵育 24 小時。在短的乾燥期後，用試驗懸浮劑噴灑葡萄籽苗至流失點、然後將其移至 20 °C 的生長箱 5 天，之後放回 20 °C 的飽和大氣中 24 小時。移出後，進行病害等級目視評定。

測試 B1

將試驗懸浮劑噴灑在番茄籽苗上至流失點。第二天，將籽苗用致病疫霉的孢子懸浮液（番茄晚疫病致病原）進行接種，並在 20 °C 的飽和大氣中孵育 24 小時，然後將其移至 20 °C 的生長箱 5 天，之後進行病害等級目視評定。

測試 B2

將番茄籽苗用致病疫霉的孢子懸浮液（番茄晚疫病致病原）進行接種，並在 20 °C 下於飽和大氣中孵育 17 小時。在短的乾燥期後，用試驗懸浮液噴灑番茄籽苗至流失點，然後將其移至 20 °C 的生長箱 4 天，之後進行病害等級目視評定。

測試 A-B2 的結果在表 A 中給出。在表中，等級 100 表示 100% 疾病控制，而等級 0 表示無疾病控制（相對於對照而言）。所有結果都是針對 10 ppm 而言，後面有表示 40 ppm 的「*」和表示 200 ppm 的「**」除外。

表 A

<u>化合物 No.</u>	<u>測試 A</u>	<u>測試 B1</u>	<u>測試 B2</u>
1	100	100	99
2	100	100	100
3	100	100	99
4	100	100	99
5	95	95	98
6	98	90	90
7	100	100	98
8	100	99	99
9	100	100	97
10	98	95	88
11	0	26	0
12	17	47	0
13	99	99	99
14	100	98	88
15	99*	39*	91*
16	100	100	99
17	66	97	47
18	100	100	98
19	99	100	94
20	100	100	99
21	100*	100*	98*
22	100	100	99
23	98	99	83
24	95*	100*	96*
25	93*	100*	58*
26	100	100	99
27	98*	100*	99*
28	98*	95*	68*
29	100	100	99
30	100*	100*	99*
31	100*	100*	99*
32	94*	100*	92*
33	0**	68**	0**

201036966

34	33**	97**	40**
35	100*	100*	99*
36	60**	100**	93**
37	75*	84*	0*
38	99*	100*	99*
39	100*	100*	99*
40	97*	100*	99*
41	100	100	99
42	100	100	99
43	100	100	99
44	100	100	99
45	96	95	99
46	9*	90*	81*
47	100	100	99
48	100	100	99
49	100	100	99
50	100	100	99
51	99	100	99

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※申請案號：99141182

C07D 417/04 (2006.01)

※申請日：98.12.2

※IPC 分類：C07D 417/14 (2006.01)

一、發明名稱：(中文/英文)

A01N 43/78 (2006.01)

殺真菌雜環化合物

A01N 43/40 (2006.01)

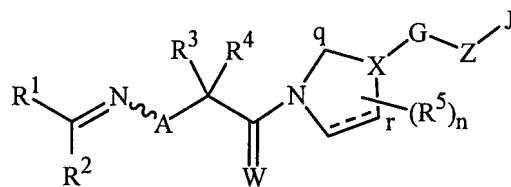
FUNGICIDAL HETEROCYCLIC COMPOUNDS

A01P 3/00 (2006.01)

(2006.01)

二、中文發明摘要：

本發明公開了式 1 化合物，包括其所有幾何和立體異構體、互變異構體、*N*-氧化物以及其鹽，



1

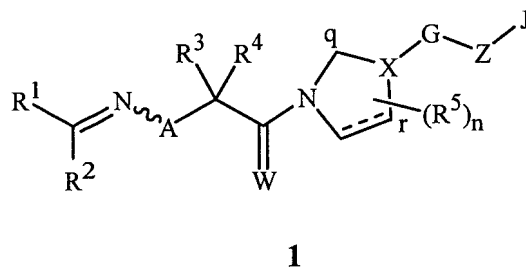
其中

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、A、W、X、G、Z、J 和 n 是如本公開中所定義。

本發明還公開了含有所述式 1 化合物的組合物和用於控制由真菌病原體引起的植物病害的方法，所述方法包括施用有效量的本發明化合物或組合物。

三、英文發明摘要：

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



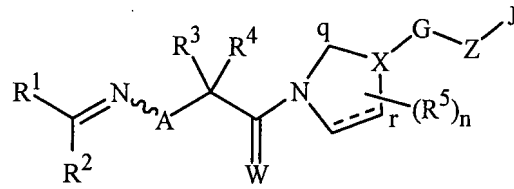
wherein

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , A, W, X, G, Z, J and n are as defined in the disclosure.

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

七、申請專利範圍：

1. 一種選自式 1 的化合物、其互變異構體、*N*-氧化物和其鹽，



1

其中

A 為 -O-、-S-、-N(R⁷)-、-C(R⁸)₂-、-OC(R⁸)₂-、-SC(R⁸)₂-
或 -N(R⁷)C(R⁸)₂-，

其中向左伸出的鍵連接至式 1 的氮原子，而向右伸出的
鍵連接至式 1 的碳原子；

W 為 O 或 S；

G 為經任選取代的 5 員雜環；

Z 為直接鍵、O、C(=O)、S(=O)_m、CH(R¹²)或 N(R¹³)；

J 是 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環

系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個
雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、
最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其
中最多 3 個碳原子環員獨立選自 C(=O)和 C(=S)，
所述硫原子環員獨立選自 S(=O)_s(=NR¹¹)_f，而所述
矽原子環員獨立選自 SiR⁹R¹⁰，每個環或環系統任
選經最多 5 個獨立選自 R⁶ 的取代基取代；或者

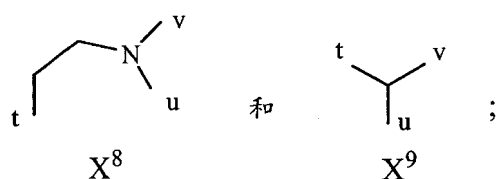
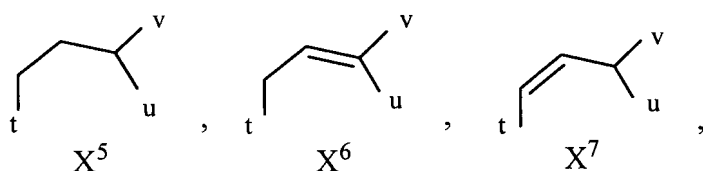
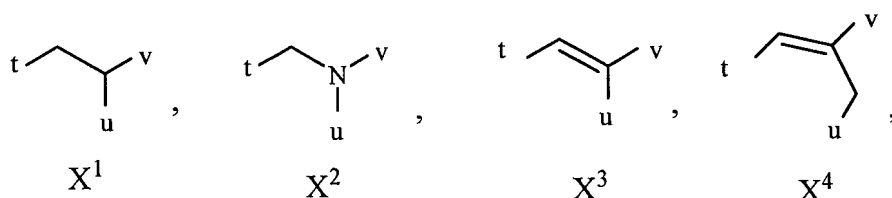
當 Z 為直接鍵時，則 J 也為 C(=W²)NT^AT^B；

W^2 為 O 或 S ；

T^A 為 H 或 C_1 - C_3 烷基 ；

T^B 為 $CR^{14}R^{15}R^{16}$ ；

X 為選自如下的基團 ：



其中 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 X^7 、 X^8 或 X^9 的用「t」標識的鍵連接至式 1 的用「q」標識的碳原子，用「u」標識的鍵連接至式 1 的用「r」標識的碳原子，而用「v」標識的鍵則連接至式 1 的 G ；

R^1 為 H、鹵素、氰基、胺基、-CHO、-C(=O)OH、-C(=O)NH₂、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_1 - C_6 鹵烷基、 C_2 - C_6 鹵烯基、 C_2 - C_6 鹵炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_3 - C_6 鹵環烷基、 C_4 - C_6 烷基環烷基、 C_4 - C_6 環烷基烷基、 C_4 - C_6 鹵環烷基烷基、 C_3 - C_6 環烯基、

C₃-C₆ 鹵環烯基、C₂-C₆ 烷氧基烷基、C₂-C₆ 烷硫基
 烷基、C₂-C₆ 烷基亞磺醯基烷基、C₂-C₆ 烷基磺醯
 基烷基、C₂-C₆ 烷基胺基烷基、C₃-C₆ 二烷基胺基
 烷基、C₂-C₆ 鹵烷基胺基烷基、C₂-C₆ 烷基羰基、
 C₂-C₆ 鹵烷基羰基、C₄-C₆ 環烷基羰基、C₂-C₆ 烷氧
 基羰基、C₄-C₆ 環烷氧基羰基、C₅-C₆ 環烷基烷氧
 基羰基、C₂-C₆ 烷基胺基羰基、C₃-C₆ 二烷基胺基
 羰基、C₁-C₆ 烷氧基、C₁-C₆ 鹵烷氧基、C₃-C₆ 環烷
 氧基、C₃-C₆ 鹵環烷氧基、C₂-C₆ 烯氧基、C₂-C₆
 鹵烯氧基、C₂-C₆ 炔氧基、C₃-C₆ 鹵炔氧基、C₂-C₆
 烷氧基烷氧基、C₂-C₆ 烷基羰基氧基、C₂-C₆ 鹵烷
 基羰基氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 鹵烷硫基、C₃-C₆
 環烷硫基、C₁-C₆ 烷基胺基、C₂-C₆ 二烷基胺基、
 C₁-C₆ 鹵烷基胺基、C₂-C₆ 鹵二烷基胺基、C₃-C₆
 環烷基胺基、C₂-C₆ 烷基羰基胺基、C₂-C₆ 鹵烷基
 羰基胺基、C₁-C₆ 烷基磺醯基胺基或 C₁-C₆ 鹵烷基
 磺醯基胺基；

R² 是 H、鹵素、氰基、羥基、C₁-C₃ 烷基、C₁-C₃ 鹵烷
 基、C₁-C₃ 烷氧基、C₁-C₃ 烷氧基或 C₁-C₃ 烷硫基；
 或

R¹ 和 R² 與它們連接的碳原子一起形成 3-至 7-員環，所
 述環含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，
 所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、
 最多 2 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳
 原子環員獨立選自 C(=O)和 C(=S)，所述硫原子環
 員獨立選自 S(=O)_s(=NR¹¹)_f，而所述矽原子環員獨

立選自 $\text{SiR}^9\text{R}^{10}$ ，所述環任選經最多 4 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 鹵烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷氧基和 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷基和 $\text{C}_1\text{-C}_2$ 烷氧基的取代基取代；

R^3 為經任選取代的苯基、經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環；或 H、鹵素、氰基、羥基、 $-\text{CHO}$ 、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 炔基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 鹵烯基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 鹵炔基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷氧基烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷硫基烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基亞磺醯基烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基磺醯基烷基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 鹵烷基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_5$ 烷氧基羰基、 $\text{C}_2\text{-C}_5$ 烷基胺基羰基、 $\text{C}_3\text{-C}_5$ 二烷基胺基羰基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷氧基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷硫基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷硫基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基亞磺醯基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基亞磺醯基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基磺醯基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基磺醯基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 烷基羰基氧基、 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 鹵烷基羰基氧基、 $\text{C}_2\text{-C}_5$ 烷氧基羰基氧基、 $\text{C}_2\text{-C}_5$ 烷基胺基羰基氧基或 $\text{C}_3\text{-C}_5$ 二烷基胺基羰基氧基；

R^4 為 H、 $\text{C}_1\text{-C}_3$ 烷基或 $\text{C}_1\text{-C}_3$ 鹵烷基；

R^3 和 R^4 與它們連接的碳原子一起形成 3-至 6-員飽和碳環；

每個 R^5 獨立地是鹵素、氰基、羥基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烯基、 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 鹵烷基或 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 烷氧基；或者

兩個 R^5 基團合在一起為 $\text{C}_1\text{-C}_4$ 伸烷基或 $\text{C}_2\text{-C}_4$ 伸烯基，以形成橋聯雙環系統或稠合的雙環系統；或者

與由雙鍵接合的相鄰環碳原子連接的兩個 R^5 基團合在一起為 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ ，該 $-\text{CH}=\text{CH}-\text{CH}=\text{CH}-$ 任選經最多 3 個獨立選自鹵素、氰基、羥基、胺基、硝基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_1-C_4 烷氧基和 C_1-C_4 鹵烷氧基的取代基取代；

每個 R^6 獨立地為 H、鹵素、氰基、羥基、胺基、硝基、 $-\text{CHO}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OH}$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NH}_2$ 、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵炔基、 C_3-C_8 環烷基、 C_3-C_8 鹵環烷基、 C_4-C_{10} 烷基環烷基、 C_4-C_{10} 環烷基烷基、 C_6-C_{14} 環烷基環烷基、 C_4-C_{10} 鹵環烷基烷基、 C_5-C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_3-C_8 環烯基、 C_3-C_8 鹵環烯基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 C_4-C_{10} 環烷氧基烷基、 C_3-C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2-C_6 烷硫基烷基、 C_2-C_6 烷基亞磺基烷基、 C_2-C_6 烷基磺基烷基、 C_2-C_6 烷基氨基烷基、 C_3-C_8 二烷基氨基烷基、 C_2-C_6 鹵烷基氨基烷基、 C_4-C_{10} 環烷基氨基烷基、 C_2-C_6 烷基羰基、 C_2-C_6 鹵烷基羰基、 C_4-C_8 環烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_4-C_8 環烷氧基羰基、 C_5-C_{10} 環烷基烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基氨基羰基、 C_3-C_8 二烷基氨基羰基、 C_4-C_8 環烷基氨基羰基、 C_2-C_6 鹵烷氧基烷基、 C_1-C_6 羥烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_3-C_8 環烷氧基、 C_3-C_8 鹵環烷氧基、 C_4-C_{10} 環烷基烷氧基、 C_2-C_6 烯氧基、 C_2-C_6 鹵烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_2-C_6 鹵炔氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷氧基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 鹵烷基羰

基氧基、C₄-C₈ 環烷基羰基氧基、C₃-C₆ 烷基羰基
 烷氧基、C₁-C₆ 烷硫基、C₁-C₆ 鹵烷硫基、C₃-C₈
 環烷硫基、C₁-C₆ 烷基亞磺醯基、C₁-C₆ 鹵烷基亞
 磺醯基、C₁-C₆ 烷基磺醯基、C₁-C₆ 鹵烷基磺醯基、
 C₃-C₈ 環烷基磺醯基、C₃-C₁₀ 三烷基矽烷基、C₁-C₆
 烷基磺醯基胺基、C₁-C₆ 鹵烷基磺醯基胺基、
 -NR¹⁷R¹⁸ 或 -Z²Q；

每個 Z² 獨立地是直接鍵、O、C(=O)、S(O)_m、CH(R¹²)
 或 N(R¹³)；

每個 Q 獨立地為苯基、苜基、萘基、5-至 6-員雜芳環
 或 8-至 11-員雜芳族雙環系統，各任選任選經最多
 2 個獨立選自碳和氮原子環員上的 R^{6b} 的取代基
 取代，並且各任選經最多 5 個獨立選自碳原子環
 員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的 C₁-C₃ 烷基、C₂-C₃
 烷基羰基、C₂-C₃ 烷氧基羰基或 C₁-C₃ 烷氧基的取
 代基取代；或者

3-至 7-員非芳族碳環、5-至 7-員非芳族雜環或 8-至 11-
 員非芳族雙環系統，每個環或環系統含有選自碳
 原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立
 選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 4 個 N 和最
 多 2 個 Si 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選
 自 C(=O)和 C(=S)，所述硫原子環員獨立選自
 S(=O)_s(=NR¹¹)_f，而所述矽原子環員獨立選自
 SiR⁹R¹⁰，每個環或環系統的碳和氮原子環員任選
 經最多 2 個獨立選自 R^{6b} 的取代基取代，最多 5
 個獨立選自碳原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上

的 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 烷氧基羰基和 C_1-C_3 烷氧基的取代基；

每個 R^{6a} 獨立地是鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_4-C_{10} 環烷基烷基、 C_4-C_{10} 烷基環烷基、 C_5-C_{10} 烷基環烷基烷基、 C_6-C_{14} 環烷基環烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵炔基、 C_3-C_6 鹵環烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 鹵烷硫基、 C_1-C_4 烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 烷基磺醯基、 C_1-C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 鹵烷基磺醯基、 C_1-C_4 烷基胺基、 C_2-C_8 二烷基胺基、 C_3-C_6 環烷基胺基、 C_2-C_4 烷氧基烷基、 C_1-C_4 羥烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 烷基羰基硫基、 C_2-C_6 烷基胺基羰基、 C_3-C_8 二烷基胺基羰基或 C_3-C_6 三烷基矽烷基；或 R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成 5-至 7-員環，所述環含有選自碳原子和任選最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，所述環任選經最多 3 個取代基獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

每個 R^{6b} 獨立地為任選經最多 3 個獨立選自如下的取代基取代的苯基：鹵素、氰基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基；或

5-至 6-員雜芳環，所述雜芳環含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 4 個 N 原子，該環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₁-C₂ 烷氧基和 C₁-C₂ 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 烷氧基的取代基取代；或

3-至 7-員非芳族環，所述環含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 4 個 N 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 C(=O)和 C(=S)，所述環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂ 鹵烷基、C₁-C₂ 烷氧基和 C₁-C₂ 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、C₁-C₂ 烷基和 C₁-C₂ 烷氧基的取代基取代；

R⁷ 是 H、氰基、C₁-C₄ 烷基、C₁-C₄ 鹵烷基、C₂-C₄ 烷氧基烷基、C₂-C₄ 烷硫基烷基、C₂-C₄ 烷基羰基、C₂-C₄ 鹵烷基羰基、C₂-C₄ 烷氧基羰基、C₂-C₄ 烷基胺基羰基、C₃-C₅ 二烷基胺基羰基、C₁-C₄ 烷基磺醯基或 C₁-C₄ 鹵烷基磺醯基；或者

R² 和 R⁷ 與它們連接的連接原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環，除了所述連接原子外，所述環還含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，所述環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、C₁-C₂ 烷基、C₁-C₂

鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

每個 R^8 獨立地為 H、 C_1-C_3 烷基或 C_1-C_3 鹵烷基；

每個 R^9 和 R^{10} 獨立地為 C_1-C_5 烷基、 C_2-C_5 烯基、 C_2-C_5 炔基、 C_3-C_5 環烷基、 C_3-C_6 鹵環烷基、 C_4-C_{10} 環烷基烷基、 C_4-C_7 烷基環烷基、 C_5-C_7 烷基環烷基烷基、 C_1-C_5 鹵烷基、 C_1-C_5 烷氧基或 C_1-C_5 鹵烷氧基；

每個 R^{11} 獨立地是 H、氰基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_3-C_8 環烷基、 C_3-C_8 鹵環烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_1-C_6 烷基胺基、 C_2-C_8 二烷基胺基、 C_1-C_6 鹵烷基胺基或苯基；

每個 R^{12} 獨立地是 H、 C_1-C_4 烷基或 C_1-C_4 鹵烷基；

每個 R^{13} 獨立地是 H、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_4 鹵烷基、 C_3-C_6 環烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_4 鹵烷基羰基、 C_2-C_4 烷氧基羰基或 C_2-C_4 鹵烷氧基羰基；

R^{14} 為 H 或 C_1-C_4 烷基；

R^{15} 為苯基、苄基、萘基或 5-至 6-員雜芳環，各在環員上任選經最多 3 個獨立選自 R^{19} 的取代基取代；

R^{16} 為 H、氰基、硝基、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基或 C_2-C_6 炔基；

每個 R^{17} 獨立地是 H、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_3-C_8 環烷基、 C_2-C_6 烷基羰基、 C_2-C_6 鹵烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基或 C_2-C_6 鹵烷氧基羰基；

每個 R^{18} 獨立地為 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_3-C_8 環烷基、 C_2-C_6 烷基羰基、 C_2-C_6 鹵烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 鹵烷氧基羰基或 $-Z^3Q$ ；

每個 R^{19} 獨立地為鹵素、氰基、羥基、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基或 C_1-C_3 烷氧基；或者

R^{16} 和 R^{19} 與它們連接的原子一起形成 3-至 7-員環，所述環含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S、最多 2 個 N 和最多 2 個 Si 原子，其中最多 2 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，所述硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而所述矽原子環員獨立選自 SiR^9R^{10} ，所述環任選經最多 4 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、羥基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

每個 Z^3 獨立地為 O、 $C(=O)$ 、 $S(O)_m$ 或 $CH(R^{12})$ ；

每個 m 獨立地為 0、1 或 2；

n 為 0、1 或 2；並且

s 和 f 在每種 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ 的情況下都獨立地為 0、1 或 2，前提條件是 s 與 f 之和為 0、1 或 2。

2. 根據申請專利範圍第 1 項所述之化合物，其中：

A 為 $-O-$ 、 $-S-$ 或 $-N(R^7)-$ ；

G 為 5-員雜環，其任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的 R^{26} 和氮原子環員上的 R^{27} 的取代基取代；

每個 R^{26} 獨立地為鹵素、 C_1-C_3 烷基或 C_1-C_3 鹵烷基；

每個 R^{27} 獨立地為 C_1 - C_3 烷基；

Z 為直接鍵、 $CH(R^{12})$ 或 $N(R^{13})$ ；

J 為 5-至 7-員環、8-至 11-員雙環系統或 7-至 11-員螺環系統，每個環或環系統含有選自碳原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 4 個 N，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$ 和 $C(=S)$ ，而所述硫原子環員獨立選自 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，每個環或環系統任選經最多 5 個獨立選自 R^6 的取代基取代；或者當 Z 為直接鍵時，J 也為 $C(=W^2)NT^A T^B$ ；

X 為 X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 、 X^6 、 X^7 或 X^8 ；

R^1 為 H、氫基、 C_1 - C_4 烷基、 C_2 - C_4 烯基、 C_2 - C_4 炔基、 C_1 - C_4 鹵烷基、 C_2 - C_4 鹵烯基、 C_2 - C_4 鹵炔基、 C_2 - C_4 烷氧基烷基、 C_2 - C_4 烷硫基烷基、 C_2 - C_4 烷基羰基、 C_2 - C_4 鹵烷基羰基、 C_2 - C_4 烷氧基羰基、 C_1 - C_4 烷氧基、 C_1 - C_4 鹵烷氧基、 C_2 - C_4 烯氧基、 C_2 - C_4 鹵烯氧基、 C_2 - C_4 炔氧基、 C_3 - C_4 鹵炔氧基、 C_2 - C_4 烷氧基烷氧基、 C_1 - C_4 烷硫基、 C_1 - C_4 鹵烷硫基、 C_1 - C_4 烷基胺基、 C_2 - C_4 二烷基胺基、 C_1 - C_4 鹵烷基胺基或 C_2 - C_4 鹵二烷基胺基；

R^2 為 H、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 烷氧基或 C_1 - C_3 鹵烷基；或者

R^1 和 R^2 與它們連接的碳原子一起形成 3-至 6-員環，所述環含有選自碳原子和最多 2 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 2 個 O、最多 2 個 S 和最多 2 個 N，其中最多 1 個碳原子環員為 $C(=O)$ 或 $C(=S)$

而所述環任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

R^3 為經任選取代的苯基或經任選取代的萘基或經任選取代的 5-至 6-員雜芳環；或 H、氰基、羥基、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烯基、 C_2-C_3 炔基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_2-C_3 鹵烯基、 C_2-C_3 鹵炔基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 鹵烷基羰基、 C_1-C_3 烷氧基、 C_1-C_3 鹵烷氧基、 C_1-C_3 烷硫基、 C_1-C_3 鹵烷硫基、 C_2-C_3 烷基羰基氧基或 C_2-C_3 鹵烷基羰基氧基；

R^4 為 H 或 C_1-C_2 烷基；

每個 R^5 獨立地為鹵素、氰基、羥基、 C_1-C_4 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基或 C_1-C_2 烷氧基；

R^6 獨立地為 H、鹵素、氰基、 C_1-C_6 烷基、 C_2-C_6 烯基、 C_2-C_6 炔基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵炔基、 C_3-C_8 環烷基、 C_3-C_8 鹵環烷基、 C_4-C_{10} 烷基環烷基、 C_4-C_{10} 環烷基烷基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 C_4-C_{10} 環烷氧基烷基、 C_3-C_8 烷氧基烷氧基烷基、 C_2-C_6 烷硫基烷基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_3-C_8 環烷氧基、 C_3-C_8 鹵環烷氧基、 C_4-C_{10} 環烷基烷氧基、 C_2-C_6 烯氧基、 C_2-C_6 鹵烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_2-C_6 鹵炔氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷氧基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 鹵烷基羰基氧基、 C_4-C_8 環烷基羰基氧基、 C_3-C_6 烷基羰基

烷氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 鹵烷硫基、 C_3-C_8 環
 烷硫基、 C_3-C_{10} 三烷基矽烷基、 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；
 每個 Z^2 獨立地為直接鍵、 O 、 $C(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 或 $CH(R_{12})$ ；
 每個 Q 獨立地為苯基、苄基、萘基、5-至 6-員雜芳環或
 8-至 11-員雜芳族雙環系統，各任選經最多 1 個選
 自碳和氮原子環員上的 R^{6b} 的取代基取代，最多 5
 個獨立選自碳原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的
 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 烷氧基羰基或
 C_1-C_3 烷氧基的取代基；或

3-至 7-員非芳族碳環、5-至 7-員非芳族雜環或 8-至
 11-員非芳族雙環系統，每個環或環系統含有選自碳
 原子和最多 4 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選
 自最多 2 個 O 、最多 2 個 S 、最多 4 個 N 和最多 2
 個 Si 原子，其中最多 3 個碳原子環員獨立選自 $C(=O)$
 和 $C(=S)$ ，所述硫原子環員獨立選自
 $S(=O)_s(=NR^{11})_f$ ，而所述矽原子環員獨立選自
 SiR^9R^{10} ，每個環或環系統任選經最多 1 個選自碳和
 氮原子環員上的 R^{6b} 的取代基取代，最多 5 個獨立
 選自碳原子環員上的 R^{6a} 和氮原子環員上的 C_1-C_3
 烷基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 烷氧基羰基和 C_1-C_3
 烷氧基的取代基；

每個 R^{6a} 獨立地為鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1-C_3
 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基、 C_1-C_3 烷氧基或 C_1-C_3 鹵烷氧
 基；或者

R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成 5-至 6-員環，所述
 環含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述

雜原子選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，所述環任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基和氮原子環員上的 C_1-C_2 烷基的取代基取代；

R^7 為 H、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 $CH_3C(=O)$ 、 $CF_3C(=O)$ 或 $CH_3OC(=O)$ ；或者

R^2 和 R^7 與它們連接的相連原子一起形成 5-至 7-員部分飽和環，除所述相連原子外，所述環還含有選自碳原子和最多 3 個雜原子的環員，所述雜原子獨立選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，所述環任選經最多 2 個獨立選自碳原子環員上的鹵素、氰基、硝基、 C_1-C_2 烷基、 C_1-C_2 鹵烷基、 C_1-C_2 烷氧基和 C_1-C_2 鹵烷氧基和氮原子環員上的氰基、 C_1-C_2 烷基和 C_1-C_2 烷氧基的取代基取代；

每個 R^{13} 獨立為 H、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烷基羰基或 C_2-C_3 烷氧基羰基；

每個 R^{18} 獨立地為 C_1-C_3 烷基或 $-Z^3Q$ ；並且

每個 Z^3 獨立地為 $C(=O)$ 或 $S(=O)_2$ 。

3. 根據申請專利範圍第 2 項所述之化合物，其中：

A 為 $-O-$ 或 $-N(R^7)-$ ；

G 為示例 2 中示出的 G-1 至 G-59 中的一者，其中向左伸出的鍵連接至 X，而向右伸出的鍵連接至式 1 中的 Z；

每個 R^{26a} 獨立選自 H 和 R^{26} ；

R^{27a} 選自 H 和 R^{27} ;

Z 為直接鍵 ;

J 為示例 3 中示出的 J-1 至 J-82 中的一者，其中該浮動鍵透過所述環或環系統中的可用碳或氮原子環員連接至式 1 中的 Z ;

X 為 1 至 5 的整數 ;

當 X 為 2、3、4 或 5 的整數時，則最多一 R^6 的例子為 $-Z^2Q$; 或者

J 為 $C(=W^2)NT^A T^B$;

W^2 為 O ;

X 為 X^1 、 X^2 或 X^3 ;

R^1 為 H、氰基、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烯基、 C_2 - C_3 炔基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_2 - C_3 鹵烯基、 C_2 - C_3 鹵炔基、 C_1 - C_3 烷氧基或 C_1 - C_3 鹵烷氧基 ;

R^2H 、 C_1 - C_3 烷基或 C_1 - C_3 鹵烷基 ;

R^3 為苯基、萘基或 5-或 6-員雜芳環，每個環或環系統任選經最多 3 個獨立選自碳原子環員上的 R^{25a} 和氮原子環員上的 R^{25b} 的取代基取代 ; 或 H、氰基、羥基、 C_1 - C_3 烷基、 C_2 - C_3 烯基、 C_2 - C_3 炔基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_2 - C_3 鹵烯基、 C_2 - C_3 鹵炔基、 C_2 - C_3 烷基羰基、 C_2 - C_3 鹵烷基羰基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 鹵烷氧基、 C_1 - C_3 烷硫基、 C_1 - C_3 鹵烷硫基、 C_2 - C_3 烷基羰基氧基或 C_2 - C_3 鹵烷基羰基氧基 ;

每個 R^{25a} 獨立地為鹵素、氰基、羥基、胺基、硝基、 C_1 - C_6 烷基、 C_2 - C_6 烯基、 C_2 - C_6 炔基、 C_3 - C_6 環烷基、 C_4 - C_{10} 環烷基烷基、 C_4 - C_{10} 烷基環烷基、 C_5 - C_{10} 烷基環烷

基烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_2-C_6 鹵烯基、 C_2-C_6 鹵炔基、 C_3-C_6 鹵環烷基、 C_1-C_4 烷氧基、 C_1-C_4 鹵烷氧基、 C_1-C_4 烷硫基、 C_1-C_4 烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 烷基磺醯基、 C_1-C_4 鹵烷硫基、 C_1-C_4 鹵烷基亞磺醯基、 C_1-C_4 鹵烷基磺醯基、 C_1-C_4 烷基胺基、 C_2-C_8 二烷基胺基、 C_3-C_6 環烷基胺基、 C_2-C_4 烷氧基烷基、 C_1-C_4 羥烷基、 C_2-C_4 烷基羰基、 C_2-C_6 烷氧基羰基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 烷基羰基硫基、 C_2-C_6 烷基胺基羰基、 C_3-C_8 二烷基胺基羰基或 C_3-C_6 三烷基矽烷基；

每個 R^{25b} 獨立地為 C_1-C_6 烷基、 C_3-C_6 烯基、 C_3-C_6 炔基、 C_3-C_6 環烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_3-C_6 鹵烯基、 C_3-C_6 鹵炔基、 C_3-C_6 鹵環烷基或 C_2-C_4 烷氧基烷基；

每個 R^5 獨立地為 氰基、甲基或甲氧基；

每個 R^6 獨立地為 H、氰基、 C_1-C_6 烷基、 C_1-C_6 鹵烷基、 C_3-C_8 環烷基、 C_3-C_8 鹵環烷基、 C_2-C_6 烷氧基烷基、 C_1-C_6 烷氧基、 C_1-C_6 鹵烷氧基、 C_3-C_8 環烷氧基、 C_2-C_6 烯氧基、 C_2-C_6 鹵烯氧基、 C_2-C_6 炔氧基、 C_2-C_6 烷氧基烷氧基、 C_2-C_6 烷基羰基氧基、 C_2-C_6 鹵烷基羰基氧基、 C_1-C_6 烷硫基、 C_1-C_6 鹵烷硫基、 C_3-C_{10} 三烷基矽烷基、 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；

每個 Z^2 為直接鍵；

Q 為示例 5 中示出的 Q-1 至 Q-102 中的一者，其中向左伸出的鍵連結至式 1 中的 Z^2 ；

每個 R^{6c} 獨立選自 H、 C_1-C_3 烷基、 C_2-C_3 烷基羰基、 C_2-C_3 烷氧基羰基和 C_1-C_3 烷氧基；

p 為 0 至 5 的整數

g 為 0 至 1 的整數

每個 R^{6a} 獨立地為鹵素、羥基、胺基、氰基、硝基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基、 C_1 - C_2 烷氧基或 C_1 - C_2 鹵烷氧基；或

R^6 和 R^{6a} 與它們連接的原子一起形成經任選取代的 5-至 6-員環，所述環含有選自碳原子和最多 1 個雜原子的環員，所述雜原子選自最多 1 個 O、最多 1 個 S 和最多 1 個 N 原子，所述環的碳原子環員任選經最多 1 個獨立選自鹵素、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基的取代基取代；

R^7 為 H 或 C_1 - C_2 烷基；或

R^2 和 R^7 與它們連接的相連原子一起形成 5-至 7-員部分不飽和環，除所述相連原子外，所述環還含有選自碳的環員，所述環任選經最多 2 個獨立選自 C_1 - C_2 烷基，

每個 R^{18} 獨立地為 C_1 - C_3 烷基；並且

n 為 0 或 1。

4. 根據申請專利範圍第 3 項所述之化合物，其中：

W 為 O；

G 選自 G-1、G-2、G-7、G-8、G-14、G-15、G-23、G-24、G-26、G-27、G-36、G-37、G-38、G-49、G-50 和 G-55；

x 為 1、2 或 3；

J 選自 J-1、J-2、J-3、J-4、J-5、J-7、J-8、J-9、J-10、
J-11、J-12、J-14、J-15、J-16、J-20、J-24、J-25、
J-26、J-29、J-30、J-37、J-38、J-45 和 J-69；或

J 為示例 4 中示出的 J-83 至 J-91 中的一者，其中向左伸
出的鍵連接至 X，而向右伸出的鍵連接至式 1 中的
G，用星號(*)標識的碳原子具有立構中心；

每個 R^6 獨立地為 H、氰基、 C_1 - C_6 烷基、 C_1 - C_6 鹵烷基、
 C_1 - C_6 烷氧基、 C_1 - C_6 鹵烷氧基、 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；

每個 R^{28a} 獨立選自鹵素、羥基、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷
氧基並且連接至碳環員；

R^{28b} 選自鹵素、 C_1 - C_2 烷基和 C_1 - C_2 烷氧基；

每個 j 和 p 獨立地為 0、1 或 2；

X 為 X^1 或 X^2 ；

R^1 為 H、 C_1 - C_3 烷基或 C_1 - C_3 氟烷基；

R^2 為 H、 C_1 - C_2 烷基或 C_1 - C_3 氟烷基；

R^3 為示例 1 中示出的 U-1 至 U-11 中的一者，其中向左
伸出的鍵連接至式 1；

k 為 0、1 或 2；或者

R^3 為 H、氰基、羥基、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_1 - C_3
烷氧基、 C_1 - C_3 鹵烷氧基、 C_1 - C_3 烷硫基、 C_1 - C_3 鹵
烷硫基、 C_2 - C_3 烷基羰基氧基或 C_2 - C_3 鹵烷基羰基氧
基；

Q 選自 Q-1、Q-20、Q-32 至 Q-34、Q-45 至 Q-47、Q-60
至 Q-73、Q-76 至 Q-79、Q-84 至 Q-94 和 Q-98 至
Q-102；

每個 R^{6a} 獨立地為鹵素、羥基、氰基、 C_1 - C_2 烷基、 C_1 - C_2 鹵烷基或 C_1 - C_2 烷氧基；以及
 R^7 為 H 或甲基。

5. 根據申請專利範圍第 4 項所述之化合物，其中：

A 為 -O-；

G 選自 G-1、G-2、G-15、G-26、G-27、G-36、G-37 和 G-38；

J 選自 J-4、J-5、J-8、J-11、J-15、J-16、J-20、J-29、J-30、J-37、J-38 和 J-69；

X 為 X^1 ；

R^1 為 H、甲基、三氟甲基或 CF_3CH_2 ；

R^2 為 H、甲基或三氟甲基；

R^3 為 H、氰基、甲基、甲氧基或 $CH_3C(=O)O-$ ；

R^4 為 H；

每個 R^6 獨立地為 H、氰基、 C_1 - C_3 烷基、 C_1 - C_3 鹵烷基、 C_1 - C_3 烷氧基、 C_1 - C_3 鹵烷氧基、 $-NR^{17}R^{18}$ 或 $-Z^2Q$ ；

Q 選自 Q-1、Q-45、Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、Q-69、Q-70、Q-71、Q-72、Q-73、Q-76、Q-78、Q-79、Q-84、Q-85、Q-98、Q-99、Q-100、Q-101 和 Q-102。

6. 根據申請專利範圍第 5 項所述之化合物，其中：

G 選自 G-1、G-2、G-15、G-26 和 G-36；

x 為 1 或 2；

J 選自 J-4、J-5、J-11、J-20、J-29、J-37、J-38 和 J-69；

R^1 為甲基、三氟甲基或 CF_3CH_2 ；

R^3 為 H；

每個 R^6 獨立地為 H、 C_1-C_3 烷基、 C_1-C_3 鹵烷基或 $-Z^2Q$ ；

Q 選自 Q-45、Q-63、Q-64、Q-65、Q-68、Q-69、Q-70、
Q-71、Q-72、Q-84 和 Q-85；並且

每個 R^{6a} 獨立地為 F、Cl、Br、羥基、氰基、甲基或甲
氧基。

7. 根據申請專利範圍第 6 項所述之化合物，其中：

G 為 G-1；

x 為 1；

J 為 J-29；

R^6 為 $-Z^2Q$ ；並且

Q 選自 Q-45、Q-63、Q-70、Q-71、Q-72 和 Q-84。

8. 根據申請專利範圍第 6 項所述之化合物，其中

Q 為 Q-45；

p 為 1 或 2；並且

每個 R^{6a} 為 F。

9. 根據申請專利範圍第 6 項所述之化合物，其中

Q 為 Q-45；

p 為 1；並且

R^{6a} 為氰基或甲基。

10. 根據申請專利範圍第 1 項所述之化合物，選自：

2,2,2-三氟乙醛 2-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]-2-甲基脞；

2-[4,5-二氫-3-[2-[1-[2-[[2,2,2-三氟亞乙基)胺基]氧基]乙醯基]-4-哌啶基]-4-噻唑基]-5-異噁唑基]苜蓿；

2,2,2-三氟乙醛 *O*-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]脞；

1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[4,5-二氫-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑基-1-基]乙酮；

1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[4,5-二氫-5-甲基-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑基-1-基]乙酮；

1-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-[4,5-二氫-5,5-二甲基-3-(三氟甲基)-1*H*-吡唑-1-基]乙酮；

2,2,2-三氟乙醛, *O*-[2-[4-[4-(2,3-二氫螺[1*H*-茛-1,5'(4'*H*)-異噁唑]-3'-基)-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]脞；

2,2,2-三氟乙醛, *O*-[2-[4-[4-[4,5-二氫-5-(2-側氧(2*H*)-苯并噁唑基)-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]脞；

1,1,1-三氟-2-丙酮, *O*-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]脞；

2-丙酮, *O*-[2-[4-[4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙基]脞；

2-[4,5-二氫-3-[2-[1-[2-[[2,2,2-三氟-1-甲基亞乙基)胺基]氧基]乙醯基]-4-哌啶基]-4-噻唑基]-5-異噁唑基]苜蓿；

1,1,1-三氟-2-丙酮, *O*-[2-[4-[4-[4,5-二氫-5-(2-側氧-3-(2*H*)-
苯并噁唑基)-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙
基] 肟; 以及

2-丙酮, *O*-[2-[4-[4-[5-(1,3-二氫-1,3-二側氧-2*H*-異吡啶-2-
基)-4,5-二氫-3-異噁唑基]-2-噻唑基]-1-哌啶基]-2-側氧乙
基] 肟。

11. 一種殺真菌組合物, 包含(a)根據申請專利範圍第 1 項所
述之化合物; 和(b)至少一種其他殺真菌劑。

12. 一種殺真菌組合物, 包含(a)根據申請專利範圍第 1 項所
述之化合物; 和(b)至少一種選自表面活性劑、固體稀釋
劑和液體稀釋劑的額外組分。

13. 一種用於控制由真菌植物病原體引起的植物病害的方
法, 包括向植物或其部分或者向植物種子施用殺真菌有
效量的根據申請專利範圍第 1 項所述之化合物。

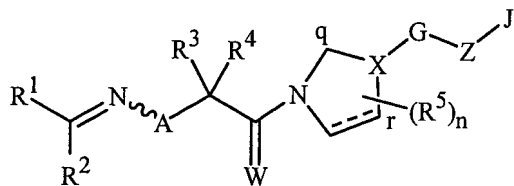
14. 一種用於控制由卵菌綱真菌植物病原體引起的植物病
害的方法, 包括向植物或其部分或者向植物種子施用殺真
菌有效量的根據申請專利範圍第 1 項所述之化合物。

四、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：(無)。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：



1