

公告

319681

申請日期	85.8.14
案號	85109824
類別	NOIN 4/02

A4
C4
319681

Int. Cl. (以上各欄由本局填註)

發明專利說明書

一、發明名稱	中文	廣效性抗菌活性化合物
	英文	BROAD-SPECTRUM ANTIMICROBIALY ACTIVE COMPOUNDS
二、發明人	姓名	(1)亞當啓東蘇 (2)彼得奧瑟吉馬 (3)巴里克利福特蘭吉 (4)羅達偉巴約瑟夫
	國籍	美國
三、申請人	住、居所	(1)美國賓州蘭斯德米契爾路1336號 (2)美國賓州荷沙姆罕德路141號 (3)美國賓州蘭斯德波雷路1031號 (4)美國賓州畢欽漢紅門路2798號
	姓名 (名稱)	羅門哈斯公司
三、申請人	國籍	美國
	住、居所 (事務所)	美國賓州費城獨立西路100號
三、申請人	代表人 姓名	威廉丹波

裝
訂
線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明(1)

本發明係關於一種廣效性抗菌活性化合物及其控制或抑制微生物之生長之用途。

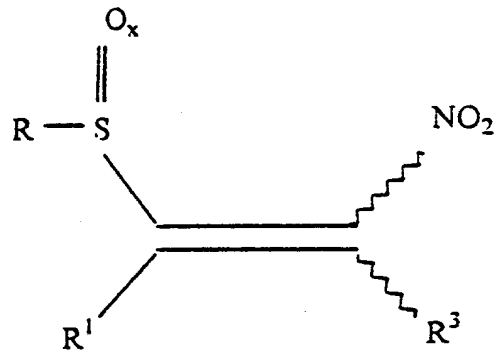
抗菌活性化合物已被習用在多種用途中以控制廣泛範圍之微生物。已知抗菌活性化合物通常係對細菌呈活性但對真菌則無效，或對真菌呈活性而對細菌無效。有多種抗菌活性化合物對細菌及真菌均呈活性，但對藻類則無效，或對藻類呈活性而對細菌及真菌無效。由於缺乏廣效活性，業界需要一種抗菌活性化合物之組合以保護其中一部位。

廣效抗菌活性化合物最好能以單一種抗菌活性化合物提供某一部位之保護作用。

本發明之目的係提供一種控制或抑制微生物生長之方法，其步驟包括在某一部位施用有效抗菌量之抗菌活性化合物。本發明之另一目的係提供一種同時具備殺真菌，殺細菌及/或殺藻類活性，並可殺滅或抑制在各個部位存在之微生物之生長之抗菌劑。

上述目的可藉本發明所揭露之內容而愈趨明晰，其中本發明係揭露一種控制或抑制微生物生長之方法，包括在特定部位施用有效抗菌活性量之下列化學式之抗菌活性化合物：

五、發明說明 (2)



其中；

R^1 係選自 R^2SO_x , H, 及 (C_1-C_{10}) 烷基；

R 及 R^2 係個別選自 (C_1-C_{10}) 烷基；

R 及 R^2 可與欲連接之原子結合形成 5-節式或 6-節式飽和或不飽和環，該環可選擇與取代或未取代苯環稠合；

R 及 R^1 可與欲連接之原子結合形成 5-節式或 6-節式飽和或不飽和環；

R^3 係選自 H, 及 (C_1-C_6) 烷基；

R^1 及 R^3 或 R 及 R^3 可與欲連接之原子結合形成 5-節式或 6-節式不飽和環；

$x=1$ 或 2；及

$y=0, 1$ 或 2。

本發明亦關於如化學式 I 所示之抗菌活性化合物，其中 R 係甲基， $x=1$ ，及 $R^3=H$ ， R^1 非硫代甲基。

取代苯基係指具有一個以上之氫原子被其他取代基所取代之苯基。適當之取代基包括 (C_1-C_3) 烷基， (C_1-C_3) 烷氧基，羥基，硝基，鹵素，氰基，及 (C_1-C_3) 烷基硫代。

五、發明說明(3)

文中“抗菌活性化合物”係包括殺真菌劑，殺細菌劑及殺藻劑，而所謂抗菌活性係包括消滅及抑制或預防諸如真菌，細菌，及藻類等微生物之生長。

Smith Kline 及法國實驗室名下之美國專利案第 4,028,379 號揭示在組胺 H₂-阻斷劑之製程中使用 1-(n-甲基亞硫醯基)-1-(n-^微甲基硫代)-2-硝基乙烯作為中間產物之方法。該項專利案並未揭示或倡議具有抗菌活性之化合物。

適用於本發明之抗菌活性化合物可藉習知烷基化方法及氧化方法製成。例如將 1,1-二硫醇-2-硝基乙烯(“PS”)溶於諸如甲醇及水或氯仿及水等溶劑混合物之攪拌溶液與適當之取代烷基化劑發生反應而形成 1,1-雙(烷基硫代)-2-硝基乙烯之產品。烷基化反應係在室溫下進行 2-48 小時。然後該產物以業界習知之各項步驟予以氧化而產生相對應之亞硫醯基或磺醯基衍生物，諸如將其溶解於冰醋酸，在 60-70℃ 溫度下攪拌，然後加入過氧化氫，或以 m-氯代過苯甲酸處理。一般上氧化反應係在 14 小時內完成。

適用於本發明之烷基化劑包括 (C₁-C₁₀) 烷基鹵化物，及 (C₂-C₁₀) 烷基二鹵化物。

本發明所用之抗菌活性化合物一般係由 E 及 Z 異構體之混合物中取得。可藉任何習知方法使異構體從混合物中分離而出，諸如柱色層分析法，高壓液體色層分析法，再結晶作用等。本發明之化合物係作為 E 及 Z 異構體之混合物，純 E 異構體，或純 Z 異構體之抗菌劑。

五、發明說明 (4)

適用於本發明之抗菌活性化合物包括：

1. 1-(甲基亞硫酸鹽基)-1-(甲基硫代)-2-硝基乙烯
2. 1-(乙基亞硫酸鹽基)-1-(乙基硫代)-2-硝基乙烯
3. 1-(正丁基亞硫酸鹽基)-1-(正丁基硫代)-2-硝基乙烯
4. 1-(正己基亞硫酸鹽基)-1-(正己基硫代)-2-硝基乙烯
5. 1-(正辛基亞硫酸鹽基)-1-(正辛基硫代)-2-硝基乙烯
6. 1-(正癸基亞硫酸鹽基)-1-(正癸基硫代)-2-硝基乙烯
7. 1-(正十二烷基亞硫酸鹽基)-1-(正十二烷基硫代)-2-硝基
基 乙烯 *苯甲氧*
8. 1-(正 苄基亞硫酸鹽基)-1-(正 苄基硫代)-2-硝基 乙 烯 *苯甲氧*
9. 1,1-雙(甲基亞硫酸鹽基)-2-硝基 乙 烯
10. 2-(硝基亞甲基)-1-氧化物-1,3-二噻茂烷
11. 2-(硝基亞甲基)-1-氧化物-1,3-二噻烷
12. 1-硝基-2-(甲基亞硫酸鹽基)環戊烯
13. 1-硝基-2-(甲基亞硫酸鹽基)環己烯
14. 1-硝基-2-(甲基磺鹽基)環戊烯
15. 1-硝基-2-(甲基磺鹽基)環己烯
16. 1-硝基-2-(苯基亞硫酸鹽基)環戊烯
17. 1-硝基-2-(苯基亞硫酸鹽基)環己烯
18. 1-硝基-2-(苯基磺鹽基)環戊烯
19. 1-硝基-2-(苯基磺鹽基)環己烯
20. 5-硝基-3,4-二氫-2H-1-氧化物-噻喃
21. 2-硝基亞甲基-1,3-苯並二硫酚 -1-S-*氧化物*
22. 2-硝基亞甲基-6-甲基-1,3-苯並二硫酚-1-S-氧化物

五、發明說明(5)

23. 2-乙基亞硫酸基-1-硝基丁烯

其中以抗菌活性化合物1最可取。

將有效抗菌量之一種以上之上述化合物施用於受到微生物侵襲之部位上即可抑制微生物之生長。該部位諸如木材，漆料，黏著劑，填隙劑，膠泥，乳膠，漿粕及紙漿，織物，皮革，塑料，卡紙板，潤滑劑，化粧品，洗潔劑，家用產品，工業用冷卻水，金屬加工液，顏料漿，攝像加工處理液，及燃料等均可獲得保護。

適用以抑制微生物生長之抗菌活性化合物之用量係大約5至300ppm，以該部位之重量為準。一般上，抗菌活性化合物係連同諸如水，溶劑等載體一起應用。

習知抗菌活性化合物之性能可藉與一種以上另類抗菌活性化合物組合使用而獲增強。因此，其他習知之抗菌活性化合物可與本發明之抗菌活性化合物組合使用。

實施例1 - 1,1-雙(烷基硫代)-2-硝基乙烯之製備

1,1-雙(烷基硫代)-2-硝基-乙烯可藉以下兩種通用方法予以製成。

通用方法A: 於160ml之甲醇，240ml之水，及0.16mol之PS之攪拌溶液中滴加入0.32mol之烷基鹵化物。混合物經過數小時之攪拌後過濾反應混合物，以水洗滌固體物質，然後再以乙醇洗滌之，產生1,1-雙(烷基硫代)-2-硝基乙烯化合物。

通用方法B: 於150ml之氯仿，150ml之水，及0.10mol之PS中滴加入0.2mol之烷基鹵化物。當烷基鹵化物

五、發明說明(6)

滴加完畢後，加入 0.05mol 之四丁基溴化銨。溶液在室溫下經過二天之攪拌，然後將有機層分離。以氯仿萃取水性層。以水結合及洗滌有機溶液，然後用無水硫酸鈉使之乾燥。溶液經過過濾，溶劑在減壓下予以去除，然後以矽膠柱體對產物進行色層分析，並以 1:10 醋酸乙酯：石油醚溶液洗淨取得 1,1-雙(烷基硫代)-2-硝基乙烯化合物。

實施例 2 - 1,1-雙(烷基硫代)-2-硝基乙烯之氧化

以下列兩種方法之其中一種將上述製備之 1,1-雙(烷基硫代)-2-硝基-乙烯化合物進行氧化及離析作用。

通用方法 C: 於 10mmol 之溶於 45ml 冰醋酸中之 1,1-雙(烷基硫代)-2-硝基乙烯之攪拌溶液中滴加入 10mmol 之過氧化氫之攪拌溶液。混合物在 60-65℃ 溫度下攪拌 12 小時，然後在減壓下去除溶劑。

通用方法 D: 以方法 C 製備化合物。一旦溶劑在減壓下被去除後，以矽膠柱體對該溶液進行色層分析法及以 1:7 之醋酸乙酯-石油醚溶液洗淨。

實施例 3 - 1,1-雙(正丁基硫代)-2-硝基乙烯之製備

以通用方法 B 從正丁基碘化物及作為始用材料之 PS 製成 1,1-雙-(正丁基硫代)-2-硝基乙烯。產物以 97% 生產率取得，呈紅褐色油體，予以辨認。¹H-NMR(CDCl₃); δ 7.10 (s, 1H), 3.03(t, 3H), 2.94(t, 3H), 1.40-1.80(m, 8H), 0.95(t, 3H), 0.93ppm(t, 3H)。分析計算 C₁₀H₁₉NO₂S₂: C, 48.16; H, 7.68; N, 5.61。發現 C, 48.17; H, 6.95; N, 5.62。

五、發明說明 (7)

實施例 4 - 1-(正丁基亞硫醯基)-1-(正丁基硫代)-2-硝基
乙烯之 E 及 Z-異構體之製備

以通用方法 D 從 1,1-雙(正丁基硫代)-2-硝基乙烯製
備成 1-(正丁基亞硫醯基)-1-(正丁基硫代)-2-硝基乙烯之
E 及 Z-異構體之混合物。以 20% 生產率(異構體 1) 及 45%
生產率(異構體 2) 取得油質產物, 予以辨認。異構體 1:
 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$; δ 7.66(s, 1H), 3.02-3.23(m, 2H), 2.73-
2.93(m, 2H), 1.65-1.95(m, 4H), 1.40-1.60(m, 4H), 0.98
(t, 3H), 0.96 ppm(t, 3H)。分析計算 $\text{C}_{10}\text{H}_{19}\text{NO}_2\text{S}_2$: C, 45.52;
H, 7.21; N, 5.27。發現 C, 45.19; H, 7.27; N, 4.95。異構
體 2: $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$; δ 6.93(s, 1H), 2.73-3.25(m, 4H),
1.43-2.05(m, 8H), 0.97(t, 3H), 0.96 ppm(t, 3H)。分析計
算發現 C, 45.50; H, 7.41; N, 5.26。

實施例 5 - 1,1-雙(正十二烷基硫代)-2-硝基乙烯之製備

以通用方法 B 從正十二烷基碘化物及作為始用材料之
PS 製成 1,1-雙-(正十二烷基硫代)-2-硝基乙烯。產物以 78
% 生產率取得, 呈淺黃色固體, 予以辨認。 $^1\text{H-NMR}(\text{CDCl}_3)$
; δ 7.08(s, 1H), 3.04(t, 2H), 2.94(t, 2H), 1.20-1.80(m,
40H), 0.85 ppm(t, 6H)。分析計算 $\text{C}_{26}\text{H}_{51}\text{NO}_2\text{S}_2$: C, 65.91;
H, 10.85; N, 2.96。發現 C, 65.72; H, 11.35; N, 2.81。

實施例 6 - 1-(正十二烷基亞硫醯基)-1-(正十二烷基硫代)
)-2-硝基乙烯之 E 及 Z-異構體之製備

以通用方法 D 從 1,1-雙(正十二烷基硫代)-2-硝基乙
烯製備成 1-(正十二烷基亞硫醯基)-1-(正十二烷基硫代)-

五、發明說明(8)

2-硝基乙烯之 E 及 Z-異構體之混合物。取得 54% 生產率之固體之混合物，予以辨認。分析計算 $C_{26}H_{51}NO_3S_2$: C, 63.75; H, 10.50; N, 2.86。發現 C, 63.78; H, 9.51; N, 3.07。

實施例 7 - 2-(硝基亞甲基)-1,3-二噻茂烷之製備

以通用方法 B 從 1,2-二溴代乙烯及作為始用材料之 PS 製成 2-(硝基亞甲基)-1,3-二噻茂烷。產物以 90% 生產率取得，呈黃色晶體狀，予以辨認。 $^1H-NMR(CDCl_3)$; δ 7.57 (s, 1H), 3.54 ppm (s, 4H)。

實施例 8 - 2-(硝基亞甲基)-1-氧化物-1,3-二噻茂烷之 E 及 Z 異構體之製備

以通用方法 D 從 2-(硝基亞甲基)-1,3-二噻茂烷製成 2-(硝基亞甲基)-1-氧化物-1,3-二噻茂烷之 E 及 Z 異構體之混合物。取得 37% 生產率固體之產物，予以辨認。異構體 1: $^1H-NMR(CDCl_3)$; δ 7.85 (s, 1H), 3.95-4.21 (m, 1H), 3.54-3.78 (m, 2H), 3.04-3.21 ppm (m, 1H)。

實施例 9 - 2-(硝基亞甲基)-1,3-二噻茂烷之製備

以通用方法 A 從三亞甲基二溴化物及作為始用材料之 PS 製成 2-(硝基亞甲基)-1,3-二噻茂烷。取得 82% 生產率固體之產物，予以辨認。分析計算 $C_5H_7NO_2S_2$: C, 33.88; H, 3.98; N, 7.90。發現 C, 33.12; H, 3.75; N, 7.58。

實施例 10 - 2-(硝基亞甲基)-1-氧化物-1,3-二噻茂烷之 E 及 Z 異構體之製備

以通用方法 C 從 2-(硝基亞甲基)-1,3-二噻茂烷製成 2-(硝基亞甲基)-1-氧化物-1,3-二噻茂烷之 E 及 Z 異構體之混

五、發明說明(9)

合物。取得37%生產率固體之產物，予以辨認。分析計算
 $C_5H_7NO_3S_2$: C, 31.08; H, 3.65; N, 7.25。發現 C, 30.94;
H, 3.49; N, 7.07。

實施例 11- 2-乙基亞硫鹽基-1-硝基丁烯之製備

依“有機合成”(1991)第70期第68頁所教示之硝基醇
之製備方法製成4-硝基-3-丁醇。

依“有機合成”(1991)第70期第68頁所教示之方法製
成2-乙基-1-硝基丁烷。 *2-Ethylthio-1-nitrobutane* 2

在0-5℃溫度下將三乙基胺(16.77g, 0.166mol)及乙
腈(50ml)之溶液滴加於2-乙基-1-硝基乙烷(26.50g,
0.164mol)及乙烷硫脛(11.20g, 0.164mol)之攪拌溶液
中長達30分鐘。添加完畢後，在0-5℃溫度下攪拌所生成
之溶液約一小時，然後倒入稀釋之水性鹽酸溶液(500ml)
。有機物被萃取入氯化亞甲基(3x150ml)，組合部份以脫
離子水洗淨(2x200ml)，在硫酸鎂之下乾燥，過濾及在減
壓下濃縮。產物經過蒸餾(1.5Torr., 72-75℃，內部)產
生清澈之油體，23.03g, 86%生產率。¹H-NMR(CDCl₃);
δ 1.1, t, 3H, -CH₃; 1.29, t, 3H, SCH₂CH₃; 2.5-2.85, m, 2H,
-CH₂-; 2.6q, 2H, SCH₂-; 3.28, m, 2H, CH; 4.5, d, 2H,
-CH₂NO₂。

將溶於二氯甲烷(30ml)之硫鹽基(20.16g, 0.149mol)
溶液添加於0℃之2-乙基硫代-1-硝基丁烷(23.02g, 0.141
mol)與二氯甲烷(100ml)之攪拌溶液中製成2-乙基硫代-1-
硝基丁烯。所產生之溶液在添加完畢後經過15分鐘之攪拌

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

註

訂

線

五、發明說明(10)

，在減壓下去除揮發性組份。將殘餘物溶解於二氯甲烷(100ml)中，並加入0℃之溶於二氯甲烷(30ml)之三乙基胺(14.27g, 0.141mol)之溶液中。一旦添加完畢，攪拌溶液15分鐘，然後倒入稀釋之水性鹽酸溶液(400ml)。有機物經過分離及以脫離子水(2x75ml)洗淨，在硫酸鎂之下進行乾燥，過濾及濃縮。藉矽膠柱色層分析(10:1 己烷/醋酸乙酯)產生黃色油體之產物，2.85g, 13%生產率。¹H-NMR-(CDCl₃); δ 1.26, m, 3H, -CH₃; 1.36, m, 3H, -CH₃; 2.55, q, 2H, -CH₂-; 2.92, q, 2H, SCH₂-; 7.2, s, 1H, 煙屬氫。

將水性過氧化氫(1.05g, 0.0093mol)滴加於2-乙基硫代-1-硝基丁烯(1.50g, 0.0093mol)與甲酸(20ml)之攪拌溶液中製成2-乙基亞硫醯基-1-硝基丁烯。所產生之溶液在室溫下經過18小時之攪拌。在減壓下去除溶劑，殘餘物被溶於二氯甲烷，以飽和水性碳酸氫鈉(1x50ml)及脫離子水(1x50ml)陸續予以洗滌，在脫水硫酸鎂之下乾燥，過濾及濃縮。以矽膠柱色層分析法(2:1 己烷/醋酸乙酯)淨化產生黃色油體之異構物混合物，0.42g, 25%生產率。¹H-NMR(CDCl₃): δ 1.26, m, 3H, CH₃; 1.5, t, 3H, CH₃; 2.5-2.85, m, 2H, -CH₂-; 2.85-3.2, m, 2H, SCH₂-; 7.2+7.3, 2s, 1H, 煙屬氫。

實施例12 - 物理性質數據

本發明之部份化合物之熔點列示如下：

五、發明說明 (11)

表 1 - 熔點

化合物	化合物名稱	熔點 (°C)
1.	1-(正甲基亞硫酸鹽基)-1-(正甲基硫代)-2-硝基乙烯	油體
2.	1-(正乙基亞硫酸鹽基)-1-(正乙基硫代)-2-硝基乙烯	油體
3.	1-(正丁基亞硫酸鹽基)-1-(正丁基硫代)-2-硝基乙烯	油體
4.	1-(正己基亞硫酸鹽基)-1-(正己基硫代)-2-硝基乙烯	油體
5.	1-(正辛基亞硫酸鹽基)-1-(正辛基硫代)-2-硝基乙烯	半固體
6.	1-(正癸基亞硫酸鹽基)-1-(正癸基硫代)-2-硝基乙烯	38-41
7.	1-(正十二烷基亞硫酸鹽基)-1-(正十二烷基硫代)-2-硝基乙烯	45-48
8.	1-(正苄基亞硫酸鹽基)-1-(正苄基硫代)-2-硝基乙烯	110-112
9.	1,1-雙(甲基亞硫酸鹽基)-2-硝基 乙烯	106-108
10.	2-(硝基亞甲基)-1-氧化物-1,3- 二噻茂烷	86-88
11.	2-(硝基亞甲基)-1-氧化物-1,3- 二噻烷	88-90

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁)

訂
線

經濟部中央標準局員工消費合作社印製

五、發明說明 (12)

實施例 13 - 抗菌劑試驗

陰離子表面活性劑之抗抗菌活性範圍及其對本發明之抗菌活性化合物之抗菌活性之影響係以最低抑制濃度 (MIC) 試驗測定。MIC 係在最低鹽介質 (M9G), Tryptocase Soy Broth (TSB) 或 Tryptocase Soy Broth 與陰離子表面活性劑 (TSBA) 中之化合物之二合系列稀釋液中進行測定。化合物接受 *Aspergillus niger*, *Rhodoturolo rubra*, *Escherichia coli* 及 *Pseudomonas aeruginosa* 之測試。

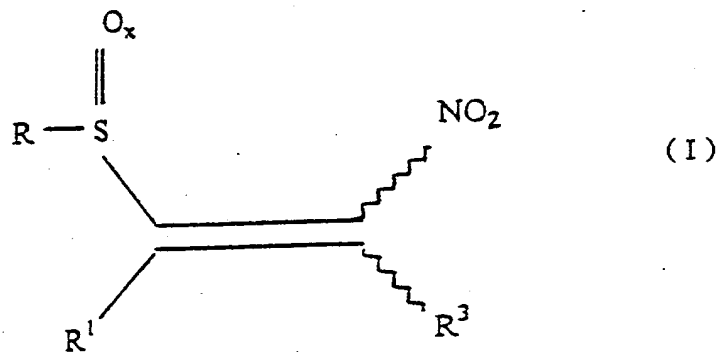
表 2

最底抑制濃度 (ppm)

化合物	E.Coli	E.Coli	P.aeruginosa	A.niger	R.Rubra	E.coli
	M9G	TSB	TSB	TSB	TSB	TSBA
1	<4	125	125	12.5	25	125
2	63	>500	>500	>50	>50	500
3	63	500	>500	6.3	6.3	500
4	>500	>500	>500	12.5	50	>500
5	>500	>500	>500	>50	>50	>500
6	>500	>500	>500	>50	>50	>500
7	>500	>500	>500	>50	>50	>500
9	125	250	125	25	50	125
10	63	500	>500	>50	>50	500
11	63	250	250	>50	>50	125

四、中文發明摘要(發明之名稱: 廣效性抗菌活性化合物)

本發明係描述一種控制或抑制微生物生長之方法，包括在特定部位施用有效抗菌活性量之下列化學式之抗菌活性化合物：



其中：

R^1 係選自 R^2SO_y ，H，及 (C_1-C_{10}) 烷基；

R 及 R^2 係個別選自 (C_1-C_{10}) 烷基；

R 及 R^2 可與欲連接之原子結合形成 5-節式或 6-節式飽和或不飽和環，該環可選擇與取代或未取代苯環稠合；

R 及 R^1 可與欲連接之原子結合形成 5-節式或 6-節式飽和環；

R^3 係選自 H，及 (C_1-C_6) 烷基；

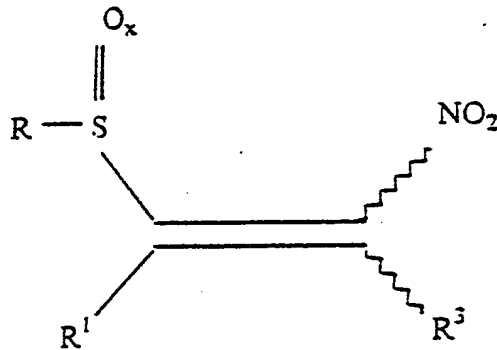
R^1 及 R^3 或 R 及 R^3 可與欲連接之原子結合形成 5-節式或 6-節式不飽和環；

$x=1$ 或 2；及

$y=0, 1$ 或 2。

四、英文發明摘要 (發明之名稱: BROAD-SPECTRUM ANTIMICROBALLY ACTIVE)
COMPOUNDS

Method of controlling or inhibiting the growth of fungi, bacteria, and algae, comprising introducing in, at, or on a locus an antimicrobially effective amount of an antimicrobially active compound of the formula



(I)

wherein

R^1 is selected from R^2SO_y , H, and (C_1-C_{18}) alkyl;

R and R^2 are independently selected from (C_1-C_{18}) alkyl;

R and R^2 can be joined, together with the atoms to which they are attached, to form a 5-membered or 6-membered saturated or unsaturated ring, said ring optionally fused to a substituted or unsubstituted phenyl ring;

R and R^1 can be joined, together with the atoms to which they are attached, to form a 5-membered or 6-membered saturated ring;

R^3 is selected from , H, and (C_1-C_6) alkyl;

R^1 and R^3 or R and R^3 can be joined, together with the atoms to which they are attached, to form a 5-membered or 6-membered unsaturated ring;

$x = 1$ or 2 ; and

$y = 0, 1, \text{ or } 2$.

(請先閱讀背面之注意事項再填寫本頁各欄)

裝

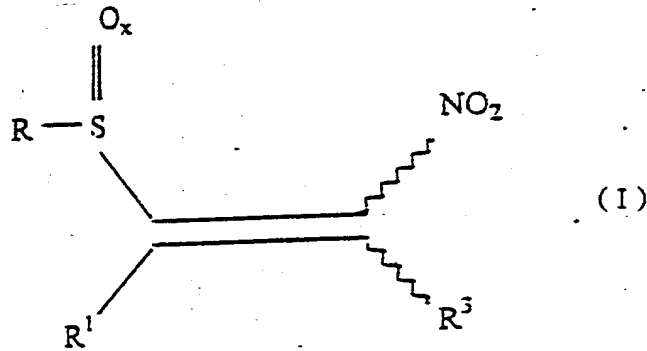
訂

線

第 85109854 號專利申請案

修正申請專利範圍

1. 一種控制或抑制真菌、細菌及藻類之生長之方法，包括在特定部位施用有效抗菌活性量之下列化學式之抗菌活性化合物：



其中；

R¹係選自 R²SO_x，H，及 (C₁-C₁₀) 烷基；

R 及 R²係個別選自 (C₁-C₁₀) 烷基；

R 及 R²可與欲連接之原子結合形成 5-節式或 6-節式飽和或不飽和環，該環可選擇與取代或未取代苯環稠合；

R 及 R¹可與欲連接之原子結合形成 5-節式或 6-節式飽和環；

R³係選自 H，及 (C₁-C₆) 烷基；

R¹及 R³或 R 及 R³可與欲連接之原子結合形成 5-節式或 6-節式不飽和環；

$x=1$ 或 2 ; 及

$y=0, 1$ 或 2 。

2. 如申請專利範圍第1項所述之方法，其中該部位包括木材，漆料，黏著劑，填隙劑，膠泥，乳膠，漿粕及紙漿，織物，皮革，塑料，卡紙板，潤滑劑，化粧品，洗潔劑，家用產品，工業用冷卻水，金屬加工液，顏料漿，攝像加工處理液，及燃料等。

3. 如申請專利範圍第1項所述之方法，其中該用以抑制微生物生長之抗菌活性化合物之用量係大約5至300 ppm，以該部位重量為準。

4. 如申請專利範圍第1項所述之方法，其中該抗菌活性化合物係選自：

1-(甲基亞硫酸基)-1-(甲基硫代)-2-硝基乙烯

1-(乙基亞硫酸基)-1-(乙基硫代)-2-硝基乙烯

1-(正丁基亞硫酸基)-1-(正丁基硫代)-2-硝基乙烯

1-(正己基亞硫酸基)-1-(正己基硫代)-2-硝基乙烯

1-(正辛基亞硫酸基)-1-(正辛基硫代)-2-硝基乙烯

1-(正癸基亞硫酸基)-1-(正癸基硫代)-2-硝基乙烯

1-(正十二烷基亞硫酸基)-1-(正十二烷基硫代)-2-硝基
乙烯

1-(正苄基亞硫酸基)-1-(正苄基硫代)-2-硝基乙烯

- 1,1-雙(甲基亞硫醯基)-2-硝基乙炔
 2-(硝基亞甲基)-1-氧化物-1,3-二噻茂烷
 2-(硝基亞甲基)-1-氧化物-1,3-二噻烷
 1-硝基-2-(甲基亞硫醯基)環戊烯
 1-硝基-2-(甲基亞硫醯基)環己烯
 1-硝基-2-(甲基磺醯基)環戊烯
 1-硝基-2-(甲基磺醯基)環己烯
 1-硝基-2-(苯基亞硫醯基)環戊烯
 1-硝基-2-(苯基亞硫醯基)環己烯
 1-硝基-2-(苯基磺醯基)環戊烯
 1-硝基-2-(苯基磺醯基)環己烯
 5-硝基-3,4-二氫-2H-1-氧化物-噻喃
 2-硝基亞甲基-1,3-苯並二硫酚-1-S-氧化物
 2-硝基亞甲基-6-甲基-1,3-苯並二硫酚-1-S-氧化物
 2-乙基亞硫醯基-1-硝基丁烯

5. 如化學式 I 所示之抗菌活性化合物，其中當該 R 係甲基， $x=1$ ，及 $R^3=H$ 時， R^1 係不為硫代甲基。