

# 發明專利說明書

200408350

(本說明書格式、順序及粗體字，請勿任意更動，※記號部分請勿填寫)

※ 申請案號：92105211

※ 申請日期：92-03-11

※IPC 分類：A01N47/24

## 壹、發明名稱：(中文/英文)

抗細菌性疾病之植物免疫作用

IMMUNIZATION OF PLANTS AGAINST BACTERIOSES

## 貳、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

德商巴地斯顏料化工廠

BASF AKTIENGESELLSCHAFT

代表人：(中文/英文)

1. 史達克

PPA. STARK

2. 衛克

PPA. WICKE

住居所或營業所地址：(中文/英文)

德國來恩河勞域沙芬市

67056 LUDWIGSHAFEN, GERMANY

國籍：(中文/英文)

德國

GERMANY

參、發明人：(共 6 人)

姓 名：(中文/英文)

- 1.海洛德 凱爾  
HARALD KOHLE
- 2.尤衛 肯洛斯  
UWE CONRATH
- 3.史蒂芬 赫蒙斯  
STEFAN HERMS
- 4.崔 雪陸狄  
TROY SCHLUNDT
- 5.尼爾 強森  
NEIL JOHNSON
- 6.哥德 史戴姆勒  
GERD STAMMLER

住居所地址：(中文/英文)

- 1.德國柏班漢市安寶雪路 13 號  
AM BUSCHEL 13, 67273 BOBENHEIM, GERMANY
- 2.德國凱可市貝巴雪衛路 21 號  
BIERBACHER WEG 21, 66459 KIRKEL 1, GERMANY
- 3.德國凱西沙奧汀市貝林街 20 號  
BERLINER STR. 20, 67659 KAISERSLAUTERN, GERMANY
- 4.美國加州圖路克市西奎西路 2060 號  
2060 W. QUINCY ROAD, TURLOCK, CA 95382, U.S.A.
- 5.美國華盛頓州凱雪蒙市蒙特史達路 5495 號  
5495 MOUNT STUART DRIVE, CASHMERE, WASHINGTON  
98815, U.S.A.
- 6.德國多山翰市康葛斯街 9 號  
KORNGASSE 9, 69221 DOSSENHEIM, GERMANY

國 籍：(中文/英文)

- 1.-3.6.均德國 GERMANY
- 4.5.均美國 U.S.A.

**肆、聲明事項：**

本案係符合專利法第二十條第一項  第一款但書或  第二款但書規定之期間，其日期為： 年 月 日。

本案申請前已向下列國家（地區）申請專利：

1. 德國；2002年03月11日；10210473.5
2. 美國；2003年02月13日；60/447,096
- 3.
- 4.
- 5.

主張國際優先權(專利法第二十四條)：

【格式請依：受理國家（地區）；申請日；申請案號數 順序註記】

1. 德國；2002年03月11日；10210473.5
2. 美國；2003年02月13日；60/447,096
- 3.
- 4.
- 5.

主張國內優先權(專利法第二十五條之一)：

【格式請依：申請日；申請案號數 順序註記】

- 1.
- 2.

主張專利法第二十六條微生物：

國內微生物 【格式請依：寄存機構；日期；號碼 順序註記】

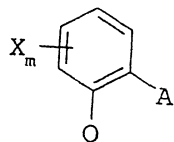
國外微生物 【格式請依：寄存國名；機構；日期；號碼 順序註記】

熟習該項技術者易於獲得，不須寄存。

## 玖、發明說明：

### 技術領域

本發明係關於一種使植物對細菌性疾病免疫之方法，其包括以有效量之式I化合物處理植物、土壤或種子：



其中

X 為鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或三氟甲基；

m 為 0 或 1；

Q 為 C(=CH-CH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>、C(=CH-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>、C(=N-OCH<sub>3</sub>)-CONHCH<sub>3</sub>、C(=N-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub> 或 N(-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>；

A 為 -O-B、-CH<sub>2</sub>O-B、-CH<sub>2</sub>S-B、-OCH<sub>2</sub>-B、-CH=CH-B、-C≡C-B、-CH<sub>2</sub>O-N=C(R<sup>1</sup>)-B 或 -CH<sub>2</sub>O-N=C(R<sup>1</sup>)-C(R<sup>2</sup>)=N-OR<sup>3</sup>，其中

B 為苯基、萘基、五員或六員雜芳基或五員或六員雜環基，其含 1 至 3 個 N 原子及 / 或一個 O 或 S 原子或一或二個 O 及 / 或 S 原子，環系統為未經取代或經一至三基團 R<sup>a</sup> 所取代；

R<sup>a</sup> 為氰基、硝基、胺基、胺基羰基、胺基硫羰基、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基硫氧基(sulfoxyl)、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>鹵烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氧羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺基、二 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺基羰基、二 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺基硫羰基、二 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺基硫羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯氧基、苯基、苯氧基、苄基、苄氧基、五員

或六員雜環基、五員或六員雜芳氧基、 $C(=NOR^\alpha)-OR^\beta$   
 或  $OC(R^\alpha)_2-C(R^\beta)=NOR^\beta$

依次，環狀基團可為未經取代或為一至三個  $R^b$  基團所取代：

$R^b$  為 氰基、硝基、鹵素、胺基、胺基羰基、胺基硫羰基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  鹵烷基、 $C_1-C_6$  烷基磺醯基、 $C_1-C_6$  烷基硫氧基 (sulfoxyl)、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  鹵烷氧基、 $C_1-C_6$  烷氧基羰基、 $C_1-C_6$  烷基硫基、 $C_1-C_6$  烷基胺基、二  $C_1-C_6$  烷基胺基、 $C_1-C_6$  烷基胺基羰基、二  $C_1-C_6$  烷基胺基羰基、 $C_1-C_6$  烷基胺基硫羰基、二  $C_1-C_6$  烷基胺基硫羰基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  烯氧基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_3-C_6$  環烯基、苯基、苯氧基、苯基硫基、苄基、苄氧基、五員或六員雜環基、五員或六員雜芳基、五員或六員雜芳基氧基或  $C(=NOR^\alpha)-OR^\beta$ ；

$R^\alpha, R^\beta$  為 氫或  $C_1-C_6$  烷基；

$R^1$  為 氫、氰基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基；

$R^2$  為 苯基、苯基羰基、苯基磺醯基、五員或六員雜芳基、五員或六員雜芳基羰基或五員或六員雜芳基磺醯基，環系統為未經取代或為一至三個  $R^a$  基團所取代；

$C_1-C_{10}$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_2-C_{10}$  烯基、 $C_2-C_{10}$  炔基、 $C_1-C_{10}$  烷基羰基、 $C_2-C_{10}$  烯基羰基、 $C_3-C_{10}$  炔基羰基、 $C_1-C_{10}$  烷基磺醯基或  $C(R^\alpha)=NOR^\beta$ ，這些基團的烴基為未經取代或為一至三個  $R^c$  基團所取代：

$R^c$  為 氰基、硝基、胺基、胺基羰基、胺基硫羰基、鹵素、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  鹵烷基、 $C_1-C_6$  烷基磺醯、 $C_1-C_6$  烷基硫氧基 (sulfoxy)、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  鹵烷氧基、 $C_1-C_6$  烷氧基羰基、 $C_1-C_6$  烷基硫基、 $C_1-C_6$  烷基胺基、二  $C_1-C_6$  烷基胺基、 $C_1-C_6$  烷基胺基羰基、二  $C_1-C_6$  烷基胺基羰基、 $C_1-C_6$  烷基胺基硫羰基、二  $C_1-C_6$  烷基胺基硫羰基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  烯基氧、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_3-C_6$  環烷基氧、五員或六員的雜環氧基、苜基、苜氧基、苜基、苜氧基、苜基硫基、五員或六員的雜芳基、五員或六員的雜芳基氧基及雜芳基硫基，其可能為環狀基團，依次為部份或全部鹵化或使其連接至一或三個  $R^a$  基團；及

$R^3$  為 氫、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基，這些基團的烴基未經取代或為一至三個  $R^c$  基團所取代；

其為植物或種子所吸收。另外，大體而言本發明係關於使用式 I 化合物以使植物對細菌性疾病免疫。

許多作物上的疾病(細菌性疾病)病原細菌普遍見於溫帶及濕暖的地區。偶而，這些疾病會造成實質上的經濟損失。常見的實例為由不同種的爾文氏菌(Erwinia)所造成整個植株的死亡(梨子及蘋果的火疫病)，及馬鈴薯和許多其他植物的細菌軟腐病，由農桿菌屬(Agrobacterium)所引發的不同植物腫瘤，黃單胞菌屬(Xanthomonas)於不同蔬菜、米及柑類的水果上所引起的壞疽。特別是由假單胞菌屬(Pseudomonas)於蔬菜、高木性果樹及菸草的細菌性疾病尤其令人擔心。

可預料的是，傳統與真菌特定之代謝過程相關之殺真菌劑並無法有效地對抗細菌性疾病。而目前可能防治它們唯一的方法係使用抗生素(例如鏈黴素、保米黴素S或嘉賜黴素)，但是很少使用此方法：大量於農業上使用抗生素一直為人所爭論，理論上，這些抗生素與用於人體及獸用藥以對抗細菌病原之作用機制相同。因此它們可能有助於抗藥性的產生。另外，由於其分子結構(大部分十分複雜)且只能用生技法製造，因此抗生素甚為昂貴。

因此開發或模擬植物本身的抗性係構成一複雜的理論。

#### 先前技術

歐洲專利EP-A 420 803描述苯并-1,2,3-噻唑衍生物對抗不同植物病原微生物之免疫效果。世界專利WO-A 96/37493中揭示具類似效果的吡啶噻唑。但是這些物質的效果通常並不足夠。

本發明的目標係提供可廣泛使用的方法，且不會與用於對抗人類及動物之細菌性疾病的工具有所抵觸，為生態上及毒理學上可接受且當引起有效抗植物細菌性疾病之免疫力時不會損傷植物。

頃已發現此目標可用起始之定義方法達成。所用之活性成分已知為殺真菌劑，於某些情況下亦為殺蟲劑(EP-A 178 826、EP-A 253 213、WO-A 93/15046、WO-A 95/18789、WO-A 95/21153、WO-A 95/21154、WO-A 95/24396、WO-A 96/01256、WO-A 97/15552)。但是目前尚未有結果顯示模擬植物之“免疫系統”，而其可導致對細菌性疾病之抗性。

## 發明內容

植物對式I活性成分之良好耐受度(控制植物疾病所須之濃度),可處理植物之地上部亦可處理植物繁殖部、種子及土壤。

根據本發明之方法,植物可經由葉面或根部吸收活性成分並於植物樹液中散佈至整個植物體。

施用本發明之方法之後的保護作用因此不只作用於直接噴灑的植物部,且整個植物對細菌性疾病之抗性亦增加。

本方法之較佳實施例,以活性成分I之調配物處理植物地上部。

用於此發明方法之活性成分製備由一開始所引用之文獻中可得知。

本發明方法中特佳的活性成份之取代基,於每一情況下單獨或結合,具下列的意思:

本發明方法中,特佳的活性成分I其中Q為 $C(=CH-OCH_3)-COOCH_3$ 、 $C(=N-OCH_3)-COOCH_3$ 或 $N(-OCH_3)-COOCH_3$ 。

式I之B較佳為苯基、吡啶基、嘧啶基、三唑基及吡唑基。

特別是,本發明特佳的活性成分之式II至VIII,其中V為 $OCH_3$ 及 $NHCH_3$ ,特別是 $OCH_3$ ,

Y為CH及N及

T及Z為各自獨立之CH及N。

較佳的活性成分式I,其中Q為 $N(-OCH_3)-COOCH_3$ ,為WO-A 93/15046及WO-A 96/01256公告中所述之化合物。

較佳的活性成分式I,其中Q為 $C(=CH-OCH_3)-COOCH_3$ ,為EP-A 178 826及EP-A 278 595中所述之化合物。



較佳的式I活性成分，其中Q為C(=N-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>，為EP-A 253 213及EP-A 254 426公告中所述之化合物。

較佳的活性成分式I，其中Q為C(=N-OCH<sub>3</sub>)-CONHCH<sub>3</sub>，為EP-A 398 692及EP-A 477 631及EP-A 628 540公告中所述之化合物。

較佳的活性成分式I，其中Q為C(=CH-CH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>，為EP-A 280 185及EP-A 350 691公告中所述之化合物。

較佳的活性成分式I，其中A為-CH<sub>2</sub>O-N=C(R<sup>1</sup>)-B，為EP-A 460 575及EP-A 463 488公告中所述之化合物。

較佳的活性成分式I，其中A為-O-B，為EP-A 382 375及EP-A 398 692公告中所述之化合物。

較佳的活性成分式I，其中A為-CH<sub>2</sub>O-N=C(R<sup>1</sup>)-C(R<sup>2</sup>)=N-OR<sup>3</sup>，為WO-A 95/18789、WO-A 95/21153、WO-A 95/21154、WO-A 97/05103及WO-A 97/06133公告中所述之化合物。

特佳的活性成分式I，其中

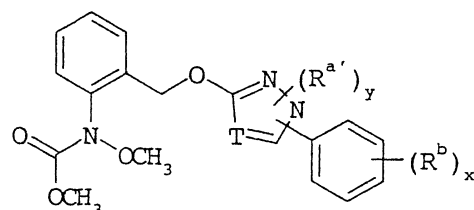
Q為N(-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>，

A為CH<sub>2</sub>-O-及

B為3-吡啶基或1,2,4-三唑基，其中B可連接至選自由

- 鹵素、甲基及三氟甲基及
- 苯基及吡啶基，特別是2-吡啶基，這些基團為一至三個R<sup>b</sup>基團所取代所組成的群組中之一或二個取代基。

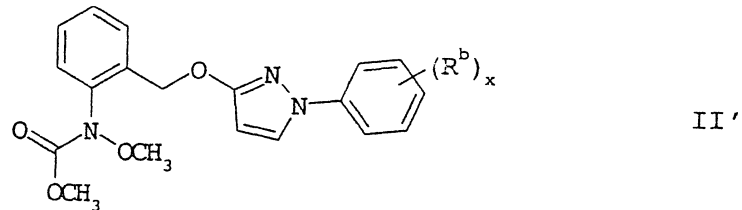
描述這些式II活性成分



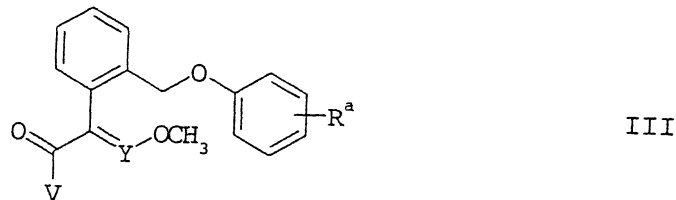
II

其中  $R^{a'}$  為氯、甲基或三氟甲基， $R^b$  如式 I 所定義， $x$  為 1 或 2，而  $y$  為 0 或 1。

特佳的活性成分亦為如式 II' 者。



另外，式 III 化合物

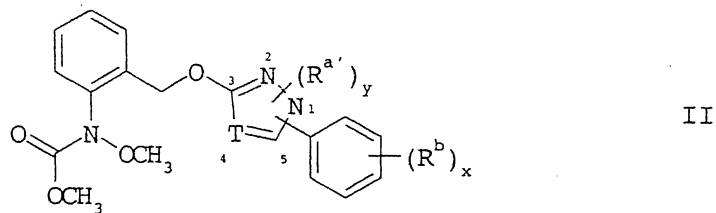


其中  $V$  為  $OCH_3$  或  $NHCH_3$ ， $Y$  為  $N$  及  $R^a$  為鹵素、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基或  $C_1-C_4$  鹵烷氧基為較佳。

活性成分式 III，其中  $V$  為  $OCH_3$  及  $R^a$  為鹵素、甲基、二甲基或三氟甲基，尤其是甲基為特佳。

使用方面來說，特佳的化合物匯編於下表中。

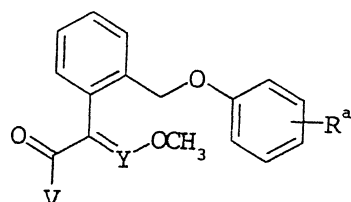
表 I



編號	T	$(R^{a'})_y$	苯基- $(R^b)_x$ 基團的位置	$(R^b)_x$	參考文獻
I-1	N	-	1	2,4-Cl <sub>2</sub>	WO-A 96/01256
I-2	N	-	1	4-Cl	WO-A 96/01256
I-3	CH	-	1	2-Cl	WO-A 96/01256
I-4	CH	-	1	3-Cl	WO-A 96/01256
I-5	CH	-	1	4-Cl	WO-A 96/01256

I-6	CH	-	1	4-CH <sub>3</sub>	WO-A 96/01256
I-7	CH	-	1	H	WO-A 96/01256
I-8	CH	-	1	3-CH <sub>3</sub>	WO-A 96/01256
I-9	CH	5-CH <sub>3</sub>	1	3-CF <sub>3</sub>	WO-A 96/01256
I-10	CH	1-CH <sub>3</sub>	5	3-CF <sub>3</sub>	WO-A 99/33812
I-11	CH	1-CH <sub>3</sub>	5	4-Cl	WO-A 99/33812
I-12	CH	1-CH <sub>3</sub>	5	-	WO-A 99/33812

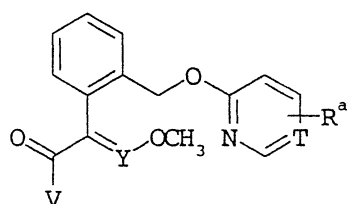
表 II



III

編號	V	Y	R <sup>a</sup>	參考文獻
II-1	OCH <sub>3</sub>	N	2-CH <sub>3</sub>	EP-A 253 213
II-2	OCH <sub>3</sub>	N	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	EP-A 253 213
II-3	NHCH <sub>3</sub>	N	2,5-(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	EP-A 477 631
II-4	NHCH <sub>3</sub>	N	2-Cl	EP-A 477 631
II-5	NHCH <sub>3</sub>	N	2-CH <sub>3</sub>	EP-A 477 631
II-6	NHCH <sub>3</sub>	N	2-CH <sub>3</sub> 、4-OCF <sub>3</sub>	EP-A 628 540
II-7	NHCH <sub>3</sub>	N	2-Cl、4-OCF <sub>3</sub>	EP-A 628 540
II-8	NHCH <sub>3</sub>	N	2-CH <sub>3</sub> 、4-OCH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub>	EP-A 11 18 609
II-9	NHCH <sub>3</sub>	N	2-Cl、4-OCH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub>	EP-A 11 18 609
II-10	NHCH <sub>3</sub>	N	2-CH <sub>3</sub> 、4-OCH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub>	EP-A 11 18 609
II-11	NHCH <sub>3</sub>	N	2-Cl、4-OCH(CH <sub>3</sub> )-C(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	EP-A 11 18 609

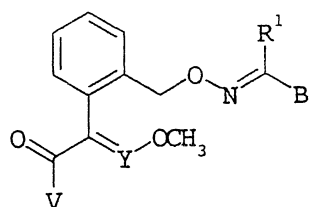
表 III



IV

編號	V	Y	T	R <sup>a</sup>	參考文獻
III-1	OCH <sub>3</sub>	CH	N	2-OCH <sub>3</sub> 、4-CF <sub>3</sub>	WO-A 96/16047
III-2	OCH <sub>3</sub>	CH	N	2-OCH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> 、4-CF <sub>3</sub>	WO-A 96/16047
III-3	OCH <sub>3</sub>	CH	CH	2-CF <sub>3</sub>	EP-A 278 595
III-4	OCH <sub>3</sub>	CH	CH	3-CF <sub>3</sub>	EP-A 278 595
III-5	NHCH <sub>3</sub>	N	CH	3-Cl	EP-A 398 692
III-6	NHCH <sub>3</sub>	N	CH	3-CF <sub>3</sub>	EP-A 398 692
III-7	NHCH <sub>3</sub>	N	CH	3-CF <sub>3</sub> 、5-Cl	EP-A 398 692
III-8	NHCH <sub>3</sub>	N	CH	3-Cl、5-CF <sub>3</sub>	EP-A 398 692

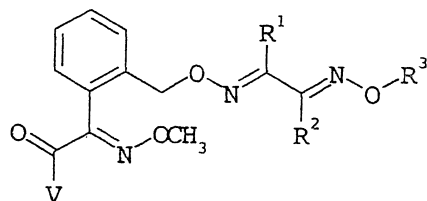
表 IV



V

編號	V	Y	R <sup>1</sup>	B	參考文獻
IV-1	OCH <sub>3</sub>	CH	CH <sub>3</sub>	(3-CF <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	EP-A 370 629
IV-2	OCH <sub>3</sub>	CH	CH <sub>3</sub>	(3,5-Cl <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	EP-A 370 629
IV-3	NHCH <sub>3</sub>	N	CH <sub>3</sub>	(3-CF <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	WO-A 92/13830
IV-4	NHCH <sub>3</sub>	N	CH <sub>3</sub>	(3-OCF <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	WO-A 92/13830
IV-5	OCH <sub>3</sub>	N	CH <sub>3</sub>	(3-OCF <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	EP-A 460 575
IV-6	OCH <sub>3</sub>	N	CH <sub>3</sub>	(3-CF <sub>3</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	EP-A 460 575
IV-7	OCH <sub>3</sub>	N	CH <sub>3</sub>	(3,4-Cl <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	EP-A 460 575
IV-8	OCH <sub>3</sub>	N	CH <sub>3</sub>	(3,5-Cl <sub>2</sub> )C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	EP-A 463 488

表 V

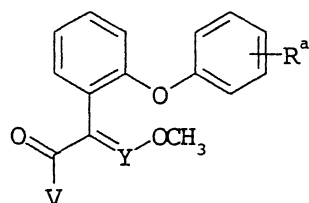


VI

編號	V	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	參考文獻
V-1	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 95/18789
V-2	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 95/18789
V-3	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 95/18789

V-4	NHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 95/18789
V-5	NHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 95/18789
V-6	NHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 95/18789
V-7	NHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 95/18789
V-8	NHCH <sub>3</sub>	Cl	4-F-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 98/38857
V-9	NHCH <sub>3</sub>	Cl	4-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	WO-A 98/38857
V-10	NHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> C(=CH <sub>2</sub> )CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 97/05103
V-11	NHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 97/05103
V-12	NHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH=C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	WO-A 97/05103
V-13	NHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH=C(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 97/05103
V-14	NHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 97/06133
V-15	NHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	O-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 97/06133
V-16	NHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C(CH <sub>3</sub> )=NOCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	WO-A 97/15552

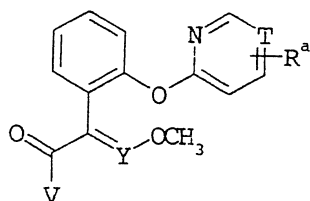
表 VI



VII

編號	V	Y	R <sup>a</sup>	參考文獻
VI-1	NHCH <sub>3</sub>	N	H	EP-A 398 692
VI-2	NHCH <sub>3</sub>	N	3-CH <sub>3</sub>	EP-A 398 692
VI-3	NHCH <sub>3</sub>	N	2-NO <sub>2</sub>	EP-A 398 692
VI-4	NHCH <sub>3</sub>	N	4-NO <sub>2</sub>	EP-A 398 692
VI-5	NHCH <sub>3</sub>	N	4-Cl	EP-A 398 692
VI-6	NHCH <sub>3</sub>	N	4-Br	EP-A 398 692

表 VII



VIII

編號	V	Y	T	R <sup>a</sup>	參考文獻
VII-1	OCH <sub>3</sub>	CH	N	4-O-(2-CN-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	EP-A 382 375
VII-2	OCH <sub>3</sub>	CH	N	4-O-(2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	EP-A 382 375
VII-3	OCH <sub>3</sub>	CH	N	4-O-(2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	EP-A 382 375
VII-4	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	GB-A 22 53 624
VII-5	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2,4-Cl <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )	GB-A 22 53 624
VII-6	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )	GB-A 22 53 624
VII-7	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2-CH <sub>3</sub> , 3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )	GB-A 22 53 624
VII-8	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )、5-F	WO-A 98/21189
VII-9	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> )、5-F	WO-A 98/21189
VII-10	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2-CH <sub>3</sub> , 3-Cl-C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )、5-F	WO-A 98/21189
VII-11	NHCH <sub>3</sub>	N	N	4-O-(2-Cl, 3-CH <sub>3</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>3</sub> )、5-F	WO-A 98/21189

式I化合物增加植物對細菌性疾病之抗性。它們在不同作物植物上(如蔬菜、高木性果樹種類及煙草)及所有這些植物種子，防治細菌尤其地重要。

特別是，它們適於防治下列的植物疾病：

煙草、蕃茄及豆類之假單胞菌屬(*Pseudomonas*)及，特別是水果、蔬菜及馬鈴薯之爾文氏菌屬(*Erwinia*)。

式III的化合物，特別是化合物II-1，特別適於防治爾文氏菌屬(*Erwinia*)。

施用有效量的活性成分之式I化合物處理植物、種子或土壤，以免於細菌的感染。於植物或種子為細菌感染前施用。可觀察到明顯地降低植物對細菌性疾病之感受性。

於作物保護之使用方面來說，施用率可介於每公頃0.01至2.0公斤的活性成分，視病原種類及植物種類而定。

處理種子方面，一般每公斤所須之活性成分的量由0.001至0.1公克，較佳的是0.01至0.05公克。

式I化合物可轉換成慣常的殺真菌調配物，例如溶液、乳

劑、懸浮劑、粉劑、粉末、糊劑及粒劑。使用形式視特定之目的而定；意欲確定於每一情況下本發明之化合物良好及一致之分布。

調配物可以已知的方法製備，例如以溶劑及/或載體延展活性成分，若有需要可使用乳化劑及分散劑，若用水作為稀釋劑則亦可能使用其他有機溶劑作為佐劑溶劑。適當的佐劑為傳統作為殺真菌劑者。

一般而言，調配物含有0.01至95% (以重量計)活性成分，較佳為0.1至90% (以重量計)。使用之活性成分其純度由90%至100%，較佳的是95%至100% (根據核磁共振圖譜)。

調配物如下例：

- I. 5份(以重量計)的本發明化合物與95份(以重量計)的甚為分散之高嶺土仔細混合。而得含5% (以重量計)活性成分之粉劑。
- II. 30份(以重量計)的本發明化合物與92份(以重量計)的粉狀矽膠及噴灑於矽膠表面上的8份(以重量計)石蠟油混合物，仔細混合。此而得具良好黏附性的調配物(含23% (以重量計)活性成分)。
- III. 10份(以重量計)的本發明化合物溶於由90份(以重量計)二甲苯、6份(以重量計) 8至10莫耳環氧乙烷與1莫耳油酸單乙醇胺之加合物、2份(以重量計)十二烷基苯磺酸鈣及2份(以重量計) 40莫耳環氧乙烷與1莫耳蓖麻油之加合物所組成的混合物中(含9% (以重量計)活性成分)。
- IV. 20份(以重量計)的本發明化合物溶於由60份(以重量計)

環己酮、30份(以重量計)異丁醇、5份(以重量計)7莫耳環氧乙烷與1莫耳異辛基酚之加合物、5份(以重量計)40莫耳環氧乙烷與1莫耳蓖麻油之加合物所組成的混合物中(含16%(以重量計)活性成分)。

- V. 80份(以重量計)的本發明化合物和3份二異丁基萘- $\alpha$ -磺酸鈉、10份(以重量計)由亞硫酸鹽廢液而來之木磺酸鈉鹽及7份(以重量計)粉狀矽膠混合完全，混合物以銼磨機研磨(含80%(以重量計)活性成分)。
- VI. 90份(以重量計)的本發明化合物與10份(以重量計)N-甲基- $\alpha$ -吡咯烷酮混合，而得一適用於液滴(microdrop)的溶液(含90%(以重量計)活性成分)。
- VII. 20份(以重量計)的本發明化合物溶於由40份(以重量計)環己酮、30份(以重量計)異丁醇、20份(以重量計)的7莫耳環氧乙烷與1莫耳異辛基酚之加合物及10份(以重量計)的40莫耳環氧乙烷與1莫耳蓖麻油之加合物所組成的混合物中。將溶液倒入100,000份(以重量計)的水中並分散充分，而得含有含0.02%(以重量計)活性成分之水性分散液。
- VIII. 20份(以重量計)的本發明化合物與3份(以重量計)二異丁基萘- $\alpha$ -磺酸鈉、17份(以重量計)由亞硫酸鹽廢液而來之木磺酸鈉鹽及60份(以重量計)粉狀矽膠混合完全，混合物以銼磨機研磨。將混合物均勻地分散於20,000份(以重量計)水中，而得含0.1%(以重量計)活性成分之噴灑混合物。



水性的使用形式通常係以濃縮乳劑、糊劑或可濕性粉末(噴灑粉末、油性分散劑)添加水製備而來。為製備乳劑、糊劑或油性分散液，該物質等或溶於油中或溶劑中，可經由濕潤劑、增黏劑、分散劑或乳化劑均質於水中。另外，亦可能製備由活性物質、濕潤劑、增黏劑、分散劑或乳化劑所組成之濃縮劑，且若適當，溶劑或油及此濃縮劑適於用水稀釋。

於即用之產品中活性成分濃度其變異的範圍甚大。一般來說，範圍為0.0001至10%較佳的是0.01至1%。

活性成分可成功地用於超微量(ULV)方法中，其可能施用含有95% (以重量計)之活性成分或甚至施用無添加物之活性成分者。

不同型式的油、殺草劑、其他殺真菌劑、其他殺蟲劑或殺細菌劑可添加至活性成分中，若適當，可於將使用前添加(槽混)。這些劑可與本發明之劑以重量1:10至10:1的比例混合。

活性成分I對細菌抗性誘發的效果可於包裝物或產品說明的註明中提及。可與活性成分I一起使用之調劑亦可提供於此註明中。

抗性的誘發亦可構成主管機關對活性成分I核准之指示內容。

式I化合物之功效可以下列實驗說明：

細菌抗性誘發的使用例

植物材料

以實驗而言，煙草植物 (*Nicotinia tabacum* cv. Xanthi-nc) 生長於種子堆肥 (標準土壤形式 ED 73) 6至8星期，25°C，溼度 59% 及每日日照週期 16 小時 ( $150-200 \mu\text{M quanta/s}^{-1}/\text{m}^{-2}$ )。為了開花有些植物每星期添加商業肥料 (總氮 10%、磷酸鹽 9%、鹽鉀 7%) 以灌溉水及建議之劑量率。

#### 活性成分之施用

活性成分以 0.1 mM 水溶液 (稀釋液以 1% v/v 二甲基二甲基亞砷 DMSO 製備) 或經極細的插管直接滲入葉片組織中。對照組植物以不含活性溶液但類似的方法處理。為使生物差異的影響減到最低，於每一情況下有些相關實驗，以活性成分的溶液處理葉片的一半，另外一半葉片以對照溶液處理之。

以下的應用及接著隨後以丁香假單胞菌 (*Pseudomonas syringae*) 接種，植物仍於生長箱中。

#### 接種/感染，抗性的判定

活性成分如上所述施用至感染丁香假單胞菌 (*Pseudomonas syringae* pv. *tomato*, DC3000, 來源：加州大學柏克萊分校的 Brian Staskawicz) 煙草植物或葉片或 *Pseudomonas syringae* pv. *tabaci* (Deutsche Sammlung von Mikroorganismen und Zellkulturen [德國微生物與細胞保存中心], Brunswick, Germany)。為此目的，細菌生長於 King's 培養基一天 30°C，離心，洗滌及於 10 mM  $\text{MgCl}_2$  溶液使密度為  $10^5 \text{ cfu/ml}^{-1}$ 。此接種液約 200  $\mu\text{l}$  ( $2 \times 10^4 \text{ cfu/ml}^{-1}$ )，以插管劃開小葉直接接種於葉片組織。

再接下來的一星期，葉片壞死作為感染的判定。沒有壞死症狀為葉片組織具誘發抗性之特色。

#### 細菌生長的判定

細菌族群的定量，將葉片感染的區域打二孔( $\phi$  1 cm)，並於 500  $\mu$ L 無菌水中均質。此稀釋序列放入 King's B Agar 平板，而於接種 30°C 兩天後，以菌落形成之數目計算每葉片盤之起始菌數濃度 (cfu)。

#### 實施方式

#### 使用實例

以活性成分 I-5 處理煙草葉片上：對 *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* DC3000 的抗性 (不相容的相互影響) 的增加及疾病症狀 (由 *Pseudomonas syringae* pv. *tabaci* 所造成) (相容的相互影響) 產生的減少

實例 1: 對 *Pseudomonas syringae* pv. *tabaci* 之免疫力 (相容的相互影響)

於相容的宿主-病原結合的情況下，應用 (接種前 24 至 48 小時)  $\leq 0.01\%$  強度之活性成分 I-5 製劑抑制了細菌的生長並減少疾病症狀的顯現。

*Pseudomonas syringae* pv. *tabaci* 根據具菌落之 King's B 培養基在有無活性成分 I-5 之生長動力曲線，證明活性成分本身於體外對細菌的生長並無影響。

因此所觀察之效果係根據植物對病原之內在防禦力或抗性之刺激。

表 A. *Pseudomonas syringae* pv. *tabaci*於接種煙草葉片之生長

時間(小時)	細菌( $\times 10^6$ 細胞/ml (葉片盤 <sup>-1</sup> ))	
	活性成分I-5	對照組
0	0	0
16	0.3	0.3
24	1.2	3.3
48	1.4	3.7

實例 2：對 *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* 之免疫力 (不相容的相互影響)

即使於不相容的相互影響之情況下，疾病症狀的顯現亦大大地減少 (即就植物本身而言很快地對病原有所反應，經由發展 (“防護”) 壞死，牽涉感染組織區域的深度)。

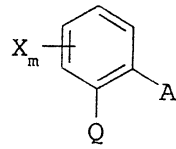
表 B：根據以 *Pseudomonas syringae* pv. *tomato* DC3000 於葉脈區域的接種，菸草葉片的感染狀況

時間(小時)	葉片的改變(葉脈區域面積之%)			
	活性成分I-5		對照組	
	萎凋症狀	壞死	萎凋症狀	壞死
0	0	0	0	0
24	0	0	100	0
48	0	5	-	100
72	0	8	-	100
144	0	15	-	100
168	0	20	-	100

施用活性成分 I-5 之調劑之後，少數顯現壞死區域直接侷限於接種部位 (該部位葉片被劃開)。24 小時之後對照組植物之葉片萎凋且於 48 小時後死亡。

## 伍、中文發明摘要：

一種使植物對細菌性疾病免疫之方法，其包括以有效量之式I化合物處理植株、土壤或種子



I

其中

X 為鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或三氟甲基；

m 為 0 或 1；

Q 為 C(=CH-CH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>、C(=CH-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>、C(=CH-OCH<sub>3</sub>)-CONHCH<sub>3</sub>、C(=N-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>、C(=N-OCH<sub>3</sub>)-CONHCH<sub>3</sub> 或 N(-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>；

A 為 -O-B、-CH<sub>2</sub>O-B、-CH<sub>2</sub>S-B、-OCH<sub>2</sub>-B、-CH=CH-B、-C≡C-B、-CH<sub>2</sub>O-N=C(R<sup>1</sup>)-B 或 -CH<sub>2</sub>O-N=C(R<sup>1</sup>)-C(R<sup>2</sup>)=N-OR<sup>3</sup>，其中

B 於每一情況下為未經取代或經取代之苯基、萘基、五員或六員雜芳基或五員或六員雜環基，其含 1 至 3 個 N 原子及 / 或一個 O-或 S 原子或一或二個 O-及 / 或 S 原子；

R<sup>1</sup> 為氫、氫基、烷基、鹵烷基、環烷基、烷氧基；

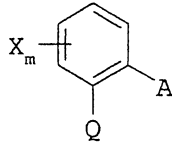
R<sup>2</sup> 為每一情況下為未經取代或經取代之苯基、苯基羰基、苯基磺醯基、五員或六員雜芳基、五員或六員雜芳基羰基或五員或六員雜芳基磺醯基，或  
 烷基、環烷基、烯基、炔基、烷基羰基、烯基羰基、炔基羰基、烷基磺醯基或 C(=NOR<sup>α</sup>)-OR<sup>β</sup>；及

R<sup>3</sup> 為氫或於每一情況下為未經取代或經取代之烷基、烯基、炔基，

該化合物為植物或種子所吸收。

## 陸、英文發明摘要：

A method of immunizing plants against bacterioses comprises treating the plants, the soil or seeds with an effective amount of a compound of the formula I



in which

X is halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl or trifluoromethyl;

m is 0 or 1;

Q is C(=CH-CH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>, C(=CH-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>, C(=CH-OCH<sub>3</sub>)-CONHCH<sub>3</sub>, C(=N-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>, C(=N-OCH<sub>3</sub>)-CONHCH<sub>3</sub> or N(-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>;

A is -O-B, -CH<sub>2</sub>O-B, -CH<sub>2</sub>S-B, -OCH<sub>2</sub>-B, -CH=CH-B, -C≡C-B, -CH<sub>2</sub>O-N=C(R<sup>1</sup>)-B or -CH<sub>2</sub>O-N=C(R<sup>1</sup>)-C(R<sup>2</sup>)=N-OR<sup>3</sup>, where

B is in each case unsubstituted or substituted phenyl, naphthyl, 5-membered or 6-membered hetaryl or 5-membered or 6-membered heterocyclyl comprising one to three N atoms and/or one O- or S atom or one or two O- and/or S atoms;

R<sup>1</sup> is hydrogen, cyano, alkyl, halogenalkyl, cycloalkyl, alkoxy;

R<sup>2</sup> is in each case unsubstituted or substituted phenyl, phenylcarbonyl, phenylsulfonyl, 5- or 6-membered hetaryl, 5- or 6-membered hetarylcarbonyl or 5- or 6-membered hetarylsulfonyl, or

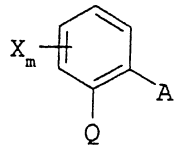
alkyl, cycloalkyl, alkenyl, alkynyl, alkylcarbonyl, alkenylcarbonyl, alkynylcarbonyl, alkylsulfonyl, or C(=NOR<sup>α</sup>)-OR<sup>β</sup>; and

R<sup>3</sup> is hydrogen or in each case unsubstituted or substituted alkyl, alkenyl or alkynyl,

which is taken up by the plants or the seeds.

## 拾、申請專利範圍：

1. 一種使植物對細菌性疾病免疫之方法，其包括以有效量式I化合物處理植物、土壤或種子，



其中

X 為鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基或三氟甲基；

m 為 0 或 1；

Q 為 C(=CH-CH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>、C(=CH-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>、C(=N-OCH<sub>3</sub>)-CONHCH<sub>3</sub>、C(=N-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub> 或 N(-OCH<sub>3</sub>)-COOCH<sub>3</sub>；

A 為 -O-B、-CH<sub>2</sub>O-B、-CH<sub>2</sub>S-B、-OCH<sub>2</sub>-B、-CH=CH-B、-C≡C-B、-CH<sub>2</sub>O-N=C(R<sup>1</sup>)-B 或 -CH<sub>2</sub>O-N=C(R<sup>1</sup>)-C(R<sup>2</sup>)=N-OR<sup>3</sup>，其中

B 為苯基、萘基、五員或六員雜芳基環或五員或六員雜環，其含 1 至 3 個 N 原子及 / 或一個 O 或 S 原子或一或二個 O 及 / 或 S 原子，環系統為未經取代或經一至三個基團 R<sup>a</sup> 所取代；

R<sup>a</sup> 為氰基、硝基、胺基、胺基羰基、胺基硫羰基、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基硫氧基(sulfoxyl)、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>鹵烷氧基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基氧羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺基、二 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺基羰基、二 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺基羰基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺基硫羰基、二 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基胺基硫羰基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>烯氧基、苯基、苯氧基、苄基、苄氧基、五員或六員雜環、五員或六員雜

雜芳基氧基、五員或六員雜芳基、 $C(=NOR^\alpha)-OR^\beta$   
或  $OC(R^\alpha)_2-C(R^\beta)=NOR^\beta$ ；

依次，環狀基團可為未經取代或為一至三個  $R^b$  基團所取代：

$R^b$  氰基、硝基、鹵素、胺基、胺基羰基、胺基硫羰基、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  鹵烷基、 $C_1-C_6$  烷基磺醯基、 $C_1-C_6$  烷基硫氧基 (sulfoxyl)、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  鹵烷氧基、 $C_1-C_6$  烷氧基羰基、 $C_1-C_6$  烷基硫基、 $C_1-C_6$  烷基胺基、二  $C_1-C_6$  烷基胺基、 $C_1-C_6$  烷基胺基羰基、二  $C_1-C_6$  烷基胺基羰基、 $C_1-C_6$  烷基胺基硫羰基、二  $C_1-C_6$  烷基胺基硫羰基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  烯氧基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_3-C_6$  環烯基、苯基、苯氧基、苯基硫基、苄基、苄氧基、五員或六員雜環、五員或六員雜芳基、五員或六員雜芳基氧基或  $C(=NOR^\alpha)-OR^\beta$ ；

$R^\alpha, R^\beta$  為氫或  $C_1-C_6$  烷基；

$R^1$  為氫、氰基、 $C_1-C_4$  烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_1-C_4$  烷氧基；

$R^2$  為苯基、苯基羰基、苯基磺醯基、五員或六員雜芳基、五員或六員雜芳基羰基或五員或六員雜芳基磺醯基，環系統為未經取代或為一至三個  $R^a$  基團所取代；

$C_1-C_{10}$  烷基、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_2-C_{10}$  烯基、 $C_2-C_{10}$  炔基、 $C_1-C_{10}$  烷基羰基、 $C_2-C_{10}$  烯基羰基、 $C_3-C_{10}$  炔基羰基、



$C_1-C_{10}$ 烷基磺醯基或  $C(R^a)=NOR^b$ ，這些基團的烴基未經取代或為一至三個  $R^c$  基團所取代：

$R^c$  為 氰基、硝基、胺基、胺基羰基、胺基硫羰基、鹵素、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  鹵烷基、 $C_1-C_6$  烷基磺醯基、 $C_1-C_6$  烷基硫氧基 (sulfoxyl)、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_6$  鹵烷氧基、 $C_1-C_6$  烷氧基羰基、 $C_1-C_6$  烷基硫基、 $C_1-C_6$  烷基胺基、二  $C_1-C_6$  烷基胺基、 $C_1-C_6$  烷基胺基羰基、二  $C_1-C_6$  烷基胺基羰基、 $C_1-C_6$  烷基胺基硫羰基、二  $C_1-C_6$  烷基胺基硫羰基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  烯基氧、 $C_3-C_6$  環烷基、 $C_3-C_6$  環烷基氧、五員或六員的雜環氧基、苜基、苜氧基、苜基、苜氧基、苜基硫基、五員或六員的雜芳基、五員或六員的雜芳基氧基及雜芳基硫基，其可能為環狀基團，依次為部份或全部鹵化或使其連接至一或三個  $R^a$  基團；及

$R^3$  為 氫、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_2-C_6$  烯基、 $C_2-C_6$  炔基，這些基團的烴基未經取代或為一至三個  $R^c$  基團所取代；

其為植物或種子所吸收。

2. 如申請專利範圍第1項之方法，其中係使用式I活性成份，其中Q為  $C(=CH-OCH_3)-COOCH_3$ 、 $C(=N-OCH_3)-COOCH_3$  或  $N(-OCH_3)-COOCH_3$ 。
3. 如申請專利範圍第1或2項之方法，其中標記m為零及式I中之取代基具下列意義：

A 為  $-O-B$ 、 $-CH_2O-B$ 、 $-CH_2O-N=C(R^1)-B$  或  $CH_2-O-N=C(R^1)-C(R^2)=N-OR^3$ ；

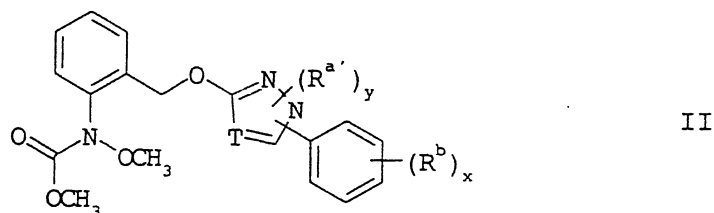
B 為苯基、吡啶基、嘧啶基、吡啶基、三唑基，其經一至二個  $R^a$  基團所取代；

$R^2$  為  $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_2$ - $C_{10}$  烯基、 $C_3$ - $C_6$  環烷基，此等基團未經取代或為一至二個  $R^b$  基團所取代；

$R^b$  為  $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_3$ - $C_6$  環烷基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基、 $C_1$ - $C_6$  鹵烷氧基、苄基、苯基或苯氧基；或未經取代或為一至二個  $R^a$  基團所取代之苯基；及

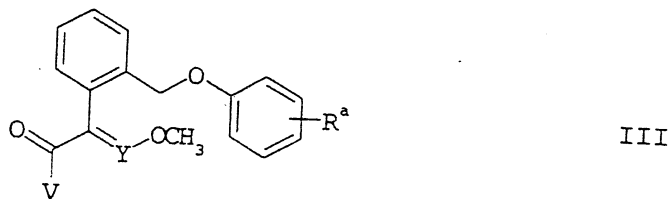
$R^3$  為  $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_2$ - $C_{10}$  烯基或  $C_2$ - $C_{10}$  炔基。

4. 如申請專利範圍第 1 或 2 項之方法，其中係使用式 II 之活性成份



其中  $R^a$  為氯、甲基或三氟甲基， $R^b$  具式 I 中所給意義，且  $x$  為 1 或 2 及  $y$  為零或 1。

5. 如申請專利範圍第 1 或 2 項之方法，其中係使用式 III 之活性成份



其中 V 為  $OCH_3$ ，Y 為 N 及  $R^a$  為甲基、二甲基或鹵素。

6. 如申請專利範圍第 1 或 2 項之方法，其係用以對爾文氏菌屬 (Erwinia) 免疫。
7. 如申請專利範圍第 1 或 2 項之方法，其中係處理植物。
8. 如申請專利範圍第 1 或 2 項之方法，其中係處理種子。
9. 一種如申請專利範圍第 1、4 或 5 項中式 I、II 或 III 之化合物之用途，其係用以使植物對細菌性疾病免疫。

**柒、指定代表圖：**

(一)本案指定代表圖為：第 ( ) 圖。

(二)本代表圖之元件代表符號簡單說明：

**捌、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：**