



(19)中華民國智慧財產局

(12)發明說明書公告本

(11)證書號數：TW I619439 B

(45)公告日：中華民國 107 (2018) 年 04 月 01 日

- (21)申請案號：103103508 (22)申請日：中華民國 103 (2014) 年 01 月 29 日
- (51)Int. Cl. : *A01N55/08 (2006.01)* *A01P1/00 (2006.01)*
A01P3/00 (2006.01)
- (30)優先權：2013/01/30 美國 61/758,313
- (71)申請人：美商農業保鮮股份有限公司(美國) AGROFRESH INC. (US)
 美國
- (72)發明人：麥可連 丹尼爾 MACLEAN, DANIEL (CA)；楊 大衛 H YOUNG, DAVID H.
 (US)；傑考森 理察 M JACOBSON, RICHARD M. (US)；葉普 毛里斯 C YAP,
 MAURICE C. (MY)；希方泰斯 羅德瑞葛 A CIFUENTES, RODRIGO A. (CL)；戴
 芙瑞斯 唐納德 H DEVRIES, DONALD H. (US)
- (74)代理人：劉法正；尹重君
- (56)參考文獻：
 WO 2007/131072A2
 Stephen J. Baker et al, "Discovery of a New Boron-Containing Antifungal Agent, 5-Fluoro-1,3-dihydro-1-hydroxy-2,1-benzoxaborole (AN2690), for the Potential Treatment of Onychomycosis.", J. Med. Chem., 2006, 49 (15), pp 4447-4450.
- 審查人員：余家嫻
- 申請專利範圍項數：30 項 圖式數：5 共 110 頁

(54)名稱

苯并氧雜硼在肉類、植物或植物部分上作為揮發性抗微生物劑之用途

USE OF BENZOXABOROLES AS VOLATILE ANTIMICROBIAL AGENTS ON MEATS, PLANTS, OR PLANT PARTS

(57)摘要

本發明係關於一種揮發性抗微生物化合物對抗影響肉類、植物或植物部分的病原體之用途。所提供的揮發性抗微生物化合物包括某些氧雜硼化合物，例如苯并氧雜硼。提供一種傳遞系統以利用這些抗微生物化合物的揮發性本質。同樣地，本發明揭示出與揮發性植物生長調節劑例如 1-甲基環丙烯之組合。

This invention is related to use of a volatile antimicrobial compound against pathogens affecting meats, plants, or plant parts. The volatile antimicrobial compounds provided include certain oxaborole compounds for example benzoxaboroles. Delivery systems are provided to take advantage of the volatile nature of these antimicrobial compounds. Also combinations with a volatile plant growth regulator, for example 1-methylcyclopropene, are disclosed.

發明專利說明書

(本說明書格式、順序，請勿任意更動)

【發明名稱】(中文/英文)

苯并氧雜硼在肉類、植物或植物部分上作為揮發性抗微生物劑之用途 / USE OF BENZOXABOROLES AS VOLATILE ANTIMICROBIAL AGENTS ON MEATS, PLANTS, OR PLANT PARTS

【技術領域】

本發明係關於苯并氧雜硼在肉類、植物或植物部分上作為揮發性抗微生物劑之用途。

【先前技術】

發明背景

[0001] 先前已經揭示出一些包含氧雜硼環的化合物。但是，尚未教導出這些氧雜硼化合物係揮發性抗微生物劑。此外，這些氧雜硼化合物尚未使用在農業應用中。

[0002] 因此，對發展出多種揮發性抗微生物劑的新用途及/或與揮發性植物生長調節劑組合，特別是用於農業應用存在有需求。

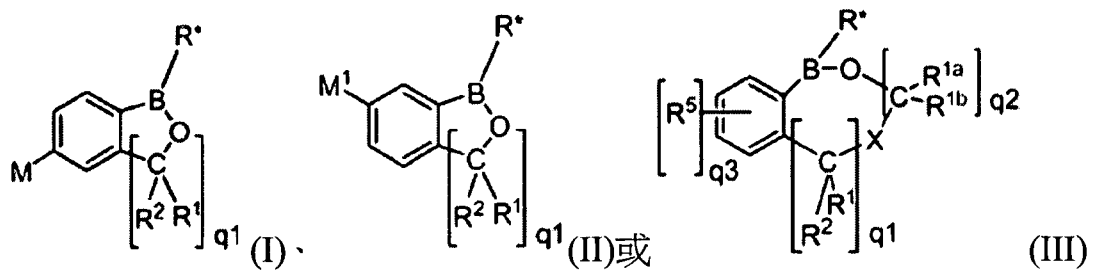
【發明內容】

發明概要

[0003] 本發明係關於一種揮發性抗微生物化合物對抗影響肉類、植物或植物部分的病原體之用途。所提供的揮發性抗微生物化合物包括某些氧雜硼化合物，例如苯并氧雜硼。提供一種傳遞系統以利用這些抗微生物化合物的揮發性本質。同樣地，揭示出與揮發性植物生長調節劑，例

如1-甲基環丙烯之組合。

[0004] 在一個態樣中，提供一種使用揮發性抗微生物化合物對抗影響肉類、植物或植物部分的病原體之方法。該方法包括讓該肉類、植物或植物部分與有效量具有式(I)、(II)或(III)之結構的揮發性抗微生物化合物接觸：



[0005] 其中q1及q2各自獨立地係1、2或3；

[0006] q3=0、1、2、3或4；

[0007] M係氫、鹵素、-OCH₃、或-CH₂-O-CH₂-O-CH₃；

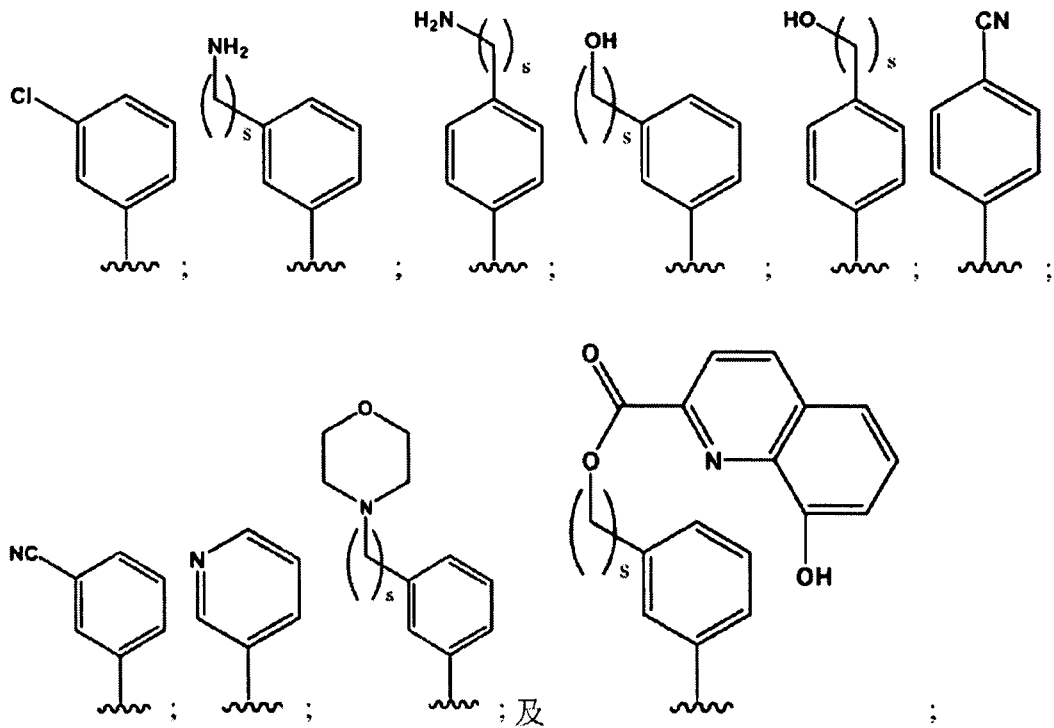
[0008] M¹係鹵素、-CH₂OH、或-OCH₃；

[0009] X係O、S或NR^{1c}，其中R^{1c}係氫、經取代的烷基或未經取代的烷基；

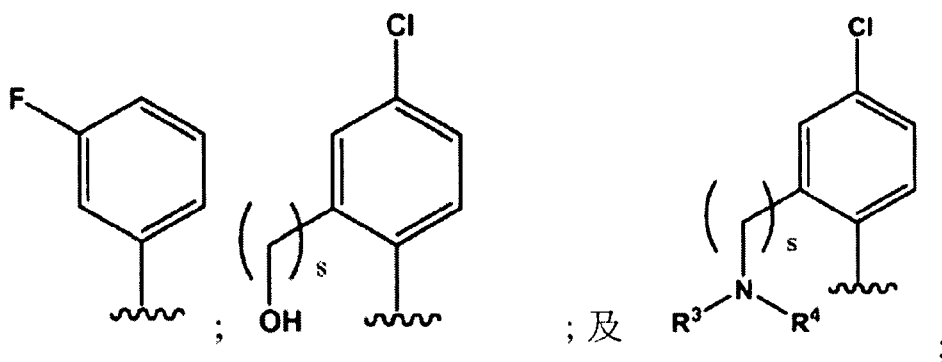
[0010] R¹、R^{1a}、R^{1b}、R²及R⁵各自獨立地係氫、OH、NH₂、SH、CN、NO₂、SO₂、OSO₂OH、OSO₂NH₂、經取代或未經取代的環烷基、經取代或未經取代的雜環烷基、經取代或未經取代的芳基、或經取代或未經取代的雜芳基；

[0011] R*係經取代或未經取代的芳基、經取代或未經取代的芳基烷基、經取代或未經取代的雜芳基、經取代或未經取代的雜芳基烷基、或經取代或未經取代的乙烯基；

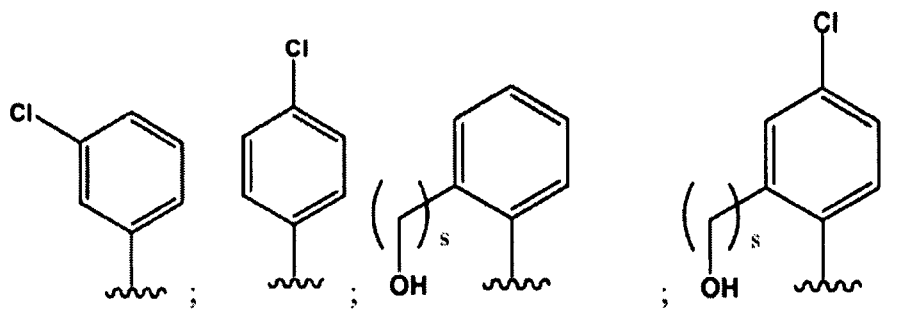
[0012] 附帶條件為當M係F時，R*不為選自於下列之成員：

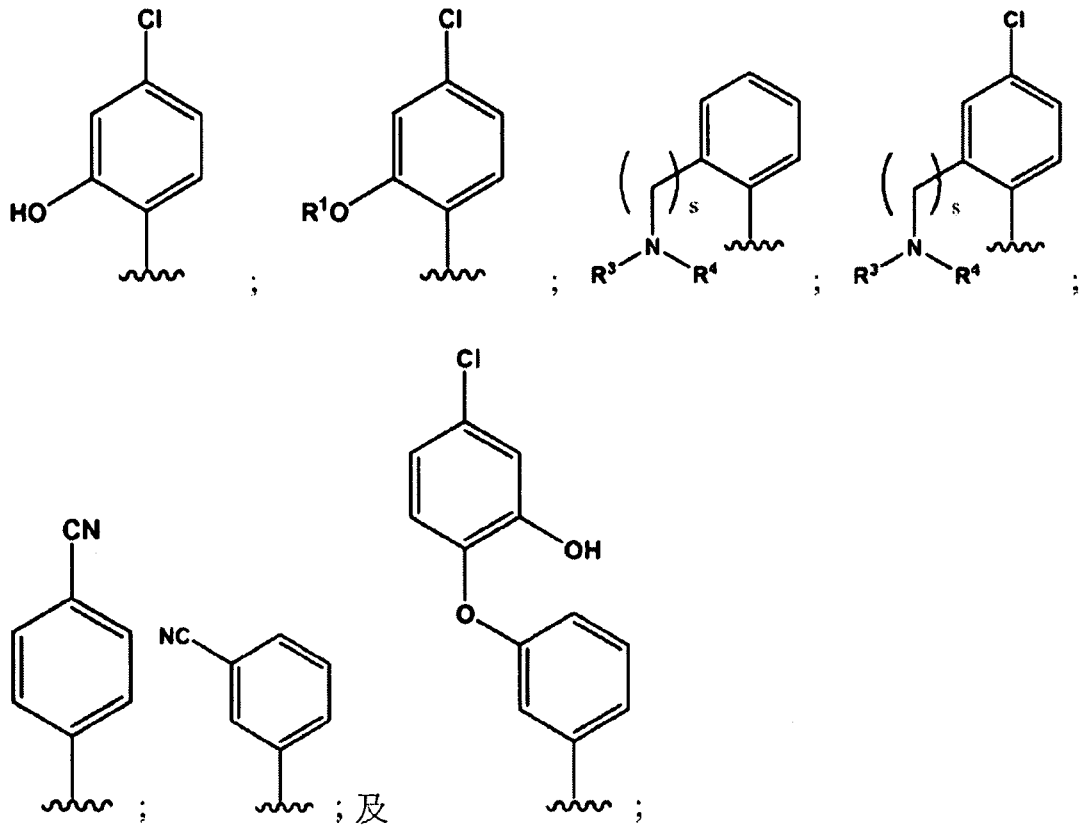


[0013] 及附帶條件為當M係Cl時，R*不為選自於下列的成員：



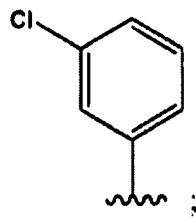
[0014] 及附帶條件為當M係氫時，R*不為選自於下列的成員：



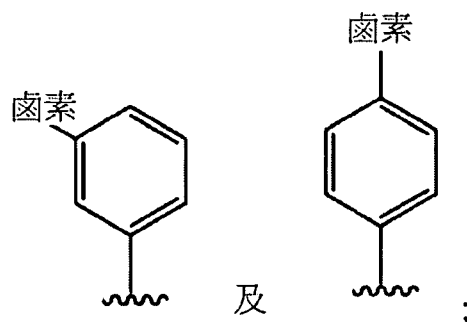


[0015] 其中 $s=1$ 或 2 ；及 R^3 及 R^4 各自獨立地係甲基或乙基；

[0016] 及限制條件為當 M 係 OCH_3 時， R^* 不為選自於下列的成員：



[0017] 及限制條件為當 $M1$ 係 F 時， R^* 不為選自於下列的成員：



[0018]及其農藝上可接受的鹽。

[0019]在所提供的方法之一個具體實例中，該病原體係選自於由下列所組成之群：鏈格孢菌(*Alternaria* spp.)、麴菌(*Aspergillus* spp.)、葡萄座腔菌(*Botryosphaeria* spp.)、灰黴菌(*Botrytis* spp.)、絲衣黴菌(*Byssochlamys* spp.)、炭疽刺盤孢菌(*Colletotrichum* spp.)、色二孢菌(*Diplodia* spp.)、鐮孢菌(*Fusarium* spp.)、地絲菌(*Geotrichum* spp.)、毛色二孢菌(*Lasiodiplodia* spp.)、鏈核黴菌(*Monolinia* spp.)、毛黴菌(*Mucor* spp.)、青黴菌(*Penicillium* spp.)、無柄盤菌(*Pezicula* spp.)、擬莖點黴菌(*Phomopsis* spp.)、疫病菌(*Phytophthora* spp.)、腐黴菌(*Pythium* spp.)、絲核菌(*Rhizoctonia* spp.)、根黴菌(*Rhizopus* spp.)、核盤菌(*Sclerotinia* spp.)及黑星菌(*Venturia* spp.)。在另一個具體實例中，該病原體係選自於由下列所組成之群：伊文氏桿菌(*Erwinia* spp.)、果膠桿菌(*Pectobacterium* spp.)、假單胞菌(*Pseudomonas* spp.)、羅爾斯頓氏菌(*Ralstonia* spp.)、黃單孢桿菌(*Xanthomonas* spp.)；沙門氏菌(*Salmonella* spp.)、大腸桿菌(*Escherichia* spp.)、李氏桿菌(*Listeria* spp.)、芽孢桿菌(*Bacillus* spp.)、志賀氏桿菌(*Shigella* spp.)及葡萄球菌(*Staphylococcus* spp.)。在另一個具體實例中，該病原體係選自於由下列所組成之群：念珠菌(*Candida* spp.)、德巴利酵母菌(*Debaryomyces* spp.)、芽孢桿菌、曲狀桿菌(*Campylobacter* spp.)、梭狀芽孢桿菌(*Clostridium* spp.)、隱孢子蟲(*Cryptosporidium* spp.)、梨形鞭毛蟲(*Giardia* spp.)、弧菌(*Vibrio* spp.)及耶爾森氏菌

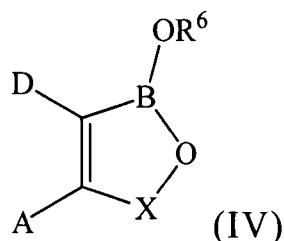
(*Yersinia* spp.)。在另一個具體實例中，該方法包括採集前處理或採集後處理。在進一步具體實例中，該採集前處理係選自於由種子處理及移植處理所組成之群。在另一個具體實例中，該採集後處理係選自於由下列所組成之群：在田野包裝期間處理、在托板輸送期間處理、盒內處理、在運輸期間處理、及在儲存及/或遍及分配網路期間處理。

[0020]在另一個具體實例中，該植物或植物部分包含轉殖基因植物或轉殖基因植物部分。在另一個具體實例中，該植物或植物部分係選自於由玉米、小麥、棉花、米、大豆及油菜所組成之群。在另一個具體實例中，該植物或植物部分選自於由果實、蔬菜、苗圃、草皮及觀賞植物所組成之群。在進一步具體實例中，該果實係選自於由下列所組成之群：香蕉、鳳梨；柑橘屬植物，包括柑橘類、檸檬、萊姆、葡萄柚及其它柑橘屬植物；葡萄、西瓜、羅馬甜瓜、哈密瓜、及其它甜瓜、蘋果、桃子、梨子、櫻桃、奇異果、芒果、油桃、番石榴、木瓜、柿子、石榴、酪梨、無花果；及漿果，包括草莓、藍莓、覆盆子、黑莓、小漿果(currents)及其它型式漿果。在進一步具體實例中，該蔬菜係選自於由下列所組成之群：蕃茄、馬鈴薯、甘薯、樹薯、胡椒、甜椒、胡蘿蔔、芹菜、笋瓜(squash)、茄子、甘藍菜、花椰菜、球花甘藍、蘆筍、磨菇、洋蔥、大蒜、韭蔥及四季豆。進一步具體實例，該花卉或花卉部分係選自於由下列所組成之群：玫瑰花、康乃馨、蘭花、天竺葵、百合花或其它觀賞植物花卉。進一步具體實例，該肉係選自於下列群組：

食用牛、野牛、雞、鹿、山羊、火雞、豬肉、羊、魚、貝類、軟體動物或乾醃肉產物。

[0021]在一個具體實例中，該接觸包括藉由選自於由下列所組成之群的方法施加該揮發性抗微生物化合物：噴灑、噴霧、熱或非熱霧化、澆灌、氣體處理及其組合。在進一步具體實例中，該氣體處理係選自於由下列所組成之群：從囊袋釋放、從合成或天然膜、纖維材料釋放、及/或從襯墊或其它包裝材料釋放、從粉末釋放、從氣體釋放產生器釋放、使用壓縮或非壓縮氣瓶釋放、在盒子內從小滴釋放、及其組合。在另一個具體實例中，該方法進一步包括讓該肉類、植物、植物部分與一揮發性植物生長調節劑接觸。在進一步具體實例中，該揮發性植物生長調節劑係一種環丙烯化合物。在進一步具體實例中，該環丙烯化合物包含1-甲基環丙烯(1-MCP)。

[0022]在另一個態樣中，提供一種使用揮發性抗微生物化合物對抗影響肉類、植物或植物部分的病原體之方法。該方法包括讓肉類、植物或植物部分與有效量的式(IV)之揮發性抗微生物化合物接觸：

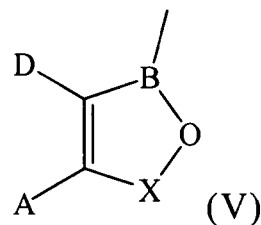


[0023]其中A及D與它們所接附的碳原子一起形成5、6或7員稠環，其可經C₁₋₆-烷基、C₁₋₆-烷氧基、羥基、鹵素、

硝基、腈、胺基、經一或多個C₁₋₆-烷基取代的胺基、羧基、醯基、芳氧基、碳醯胺基、經C₁₋₆-烷基取代的碳醯胺基、磺醯胺基或三氟甲基取代，或該稠環可連結二個氧雜硼環；

[0024] X係-CR⁷R⁸基團，其中R⁷及R⁸每個各自獨立地係氫、C₁₋₆-烷基、腈、硝基、芳基、芳烷基；或R⁷及R⁸與它們所接附的碳原子一起形成脂環族環；及

[0025] R⁶係氫、C₁₋₁₈-烷基、(經C₁₋₆-烷氧基取代的C₁₋₁₈-烷基、C₁₋₆-烷硫基、羥基、胺基、經C₁₋₁₈-烷基取代的胺基、羧基、芳基、芳氧基、碳醯胺基、(經C₁₋₆-烷基、芳基或芳烷基取代的碳醯胺基)、芳烷基、芳基、雜芳基、環烷基、C₁₋₁₈-伸烷基胺基；經苯基、C₁₋₆-烷氧基或C₁₋₆-烷硫基取代的C₁₋₁₈-伸烷基胺基；羰基伸烷基胺基或式(V)之基團：



[0026] 其中A、D及X係如先前於本文中所定義，除了硼酞內酯外；

[0027] 及其農藝上可接受的鹽。

[0028] 在所提供的方法之一個具體實例中，該病原體係選自於由下列所組成之群：鏈格孢菌、麴菌、葡萄座腔菌、灰黴菌、絲衣黴菌、炭疽刺盤孢菌、色二孢菌、鐮孢菌、地絲菌、毛色二孢菌、鏈核黴菌、毛黴菌、青黴菌、無柄盤菌、擬莖點黴菌、疫病菌、腐黴菌、絲核菌、根黴菌、

核盤菌及黑星菌。在另一個具體實例中，該病原體係選自於由下列所組成之群：伊文氏桿菌、果膠桿菌、假單胞菌、羅爾斯頓氏菌、黃單孢桿菌、沙門氏菌、大腸桿菌、李氏桿菌、芽孢桿菌、志賀氏桿菌及葡萄球菌。在另一個具體實例中，該病原體係選自於由下列所組成之群：念珠菌、德巴利酵母菌、芽孢桿菌、曲狀桿菌、梭狀芽孢桿菌、隱孢子蟲、梨形鞭毛蟲、弧菌及耶爾森氏菌。在另一個具體實例中，該方法包括採集前處理或採集後處理。在進一步具體實例中，該採集前處理係選自於由種子處理及移植處理所組成之群。在另一個具體實例中，該採集後處理係選自於由下列所組成之群：在田野包裝期間處理、在托板輸送期間處理、盒內處理、在運輸期間處理、及在儲存及/或遍及分配網路期間處理。

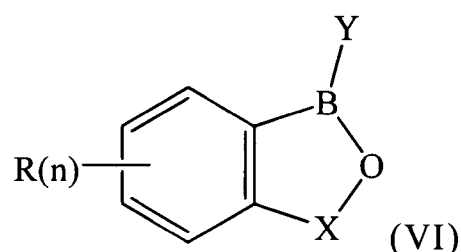
[0029]在另一個具體實例中，該植物或植物部分包含轉殖基因植物或轉殖基因植物部分。在另一個具體實例中，該植物或植物部分係選自於由玉米、小麥、棉花、米、大豆及油菜所組成之群。在另一個具體實例中，該植物或植物部分係選自於由果實、蔬菜、苗圃、草皮及觀賞植物所組成之群。在進一步具體實例中，該果實係選自於由下列所組成之群：香蕉、鳳梨；柑橘屬植物，包括柑橘類、檸檬、萊姆、葡萄柚及其它柑橘屬植物；葡萄、西瓜、羅馬甜瓜、哈密瓜、及其它甜瓜、蘋果、桃子、梨子、櫻桃、奇異果、芒果、油桃、番石榴、木瓜、柿子、石榴、酪梨、無花果；及漿果，包括草莓、藍莓、覆盆子、黑莓、小漿

果及其它型式漿果。在進一步具體實例中，該蔬菜係選自於由下列所組成之群：蕃茄、馬鈴薯、甘薯、樹薯、胡椒、甜椒、胡蘿蔔、芹菜、笋瓜、茄子、甘藍菜、花椰菜、球花甘藍、蘆筍、磨菇、洋蔥、大蒜、韭蔥及四季豆。進一步具體實例，該花卉或花卉部分係選自於由下列所組成之群：玫瑰花、康乃馨、蘭花、天竺葵、百合花或其它觀賞植物花卉。進一步具體實例，該肉係選自於下列群組：食用牛、野牛、雞、鹿、山羊、火雞、豬肉、羊、魚、貝類、軟體動物或乾醃肉產物。

[0030]在一個具體實例中，該接觸包括藉由選自於由下列所組成之群的方法施加該揮發性抗微生物化合物：噴灑、噴霧、熱或非熱霧化、澆灌、氣體處理及其組合。在進一步具體實例中，該氣體處理係選自於由下列所組成之群：從囊袋釋放、從合成或天然膜、纖維材料釋放、及/或從襯墊或其它包裝材料釋放、從粉末釋放、從氣體釋放產生器釋放、使用壓縮或非壓縮氣瓶釋放、在盒子內從小滴釋放、及其組合。在另一個具體實例中，該方法進一步包括讓該肉類、植物、植物部分與一揮發性植物生長調節劑接觸。在進一步具體實例中，該揮發性植物生長調節劑係一種環丙烯化合物。在進一步具體實例中，該環丙烯化合物包含1-甲基環丙烯(1-MCP)。

[0031]在另一個態樣中，提供一種使用揮發性抗微生物化合物對抗影響肉類、植物或植物部分的病原體之方法。該方法包括讓該肉類、植物或植物部分與有效量的式(VI)

之揮發性抗微生物化合物接觸：



[0032] 其中每個R各自獨立地係氫、烷基、烯烴、炔烴、鹵烷基、鹵烯烴、鹵炔烴、烷氧基、烯氧基、鹵烷氧基、芳基、雜芳基、芳基烷基、芳基烯烴、芳基炔烴、雜芳基烷基、雜芳基烯烴、雜芳基炔烴、鹵素、羥基、腓、胺、酯、羧酸、酮、醇、硫醚、亞砒、砒、磺醯亞胺、磺亞醯胺、磺醯胺、硫酸鹽、磺酸鹽、硝基烷基、醯胺、肟、亞胺、羥胺、胼、脞、胺基甲酸酯、硫代胺基甲酸酯、尿素、硫脲、碳酸鹽、芳氧基或雜芳氧基；

[0033] $n=1、2、3$ 或 4 ；

[0034] B係硼；

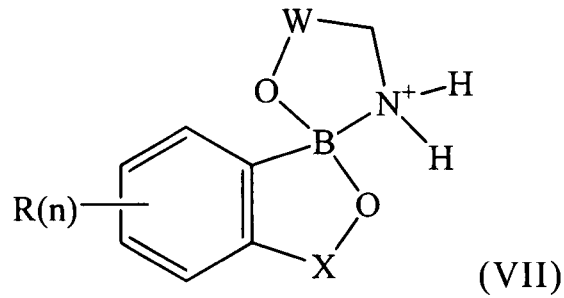
[0035] $X=(CR_2)_m$ ，其中 $m=1、2、3$ 或 4 ；

[0036] Y係烷基、烯烴、炔烴、鹵烷基、鹵烯烴、鹵炔烴、烷氧基、烯氧基、鹵烷氧基、芳基、雜芳基、芳基烷基、芳基烯烴、芳基炔烴、雜芳基烷基、雜芳基烯烴、雜芳基炔烴、羥基、腓、胺、酯、羧酸、酮、醇、硫醚、亞砒、砒、磺醯亞胺、磺亞醯胺、磺醯胺、硫酸鹽、磺酸鹽、硝基烷基、醯胺、肟、亞胺、羥胺、胼、脞、胺基甲酸酯、硫代胺基甲酸酯、尿素、硫脲、碳酸鹽、芳氧基或雜芳氧基；

[0037] 附帶條件為當Y係羥基時，R不為芳氧基或雜芳氧基；

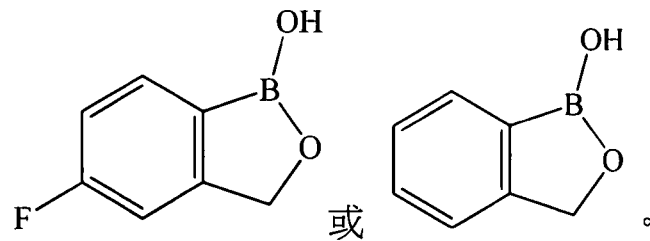
[0038] 及其農藝上可接受的鹽。

[0039] 在一個具體實例中，該揮發性抗微生物化合物具有式(VII)之結構：



[0040] 其中 $W=(CH_2)_q$ ，其中q係1、2或3。

[0041] 在另一個具體實例中，該揮發性抗微生物化合物具有下列結構：



[0042] 在所提供的方法之一個具體實例中，該病原體係選自於由下列所組成之群：鏈格孢菌、麴菌、葡萄座腔菌、灰黴菌、絲衣黴菌、炭疽刺盤孢菌、色二孢菌、鐮孢菌、地絲菌、毛色二孢菌、鏈核黴菌、毛黴菌、青黴菌、無柄盤菌、擬莖點黴菌、疫病菌、腐黴菌、絲核菌、根黴菌、核盤菌及黑星菌。在另一個具體實例中，該病原體係選自於由下列所組成之群：伊文氏桿菌、果膠桿菌、假單胞菌、羅爾斯頓氏菌、黃單孢桿菌、沙門氏菌、大腸桿菌、李氏

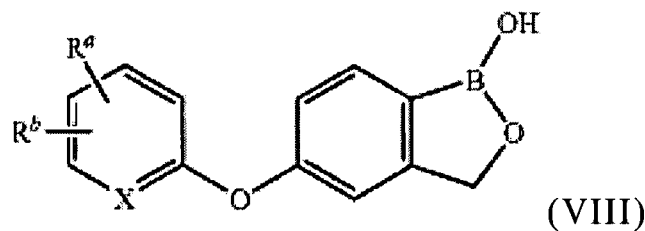
桿菌、芽孢桿菌、志賀氏桿菌及葡萄球菌。在另一個具體實例中，該病原體係選自於由下列所組成之群：念珠菌、德巴利酵母菌、芽孢桿菌、曲狀桿菌、梭狀芽孢桿菌、隱孢子蟲、梨形鞭毛蟲、弧菌及耶爾森氏菌。在另一個具體實例中，該方法包括採集前處理或採集後處理。在進一步具體實例中，該採集前處理係選自於由種子處理及移植處理所組成之群。在另一個具體實例中，該採集後處理係選自於由下列所組成之群：在田野包裝期間處理、在托板輸送期間處理、盒內處理、在運輸期間處理、及在儲存及/或遍及分配網路期間處理。

[0043]在另一個具體實例中，該植物或植物部分包含轉殖基因植物或轉殖基因植物部分。在另一個具體實例中，該植物或植物部分係選自於由玉米、小麥、棉花、米、大豆及油菜所組成之群。在另一個具體實例中，該植物或植物部分選自於由果實、蔬菜、苗圃、草皮及觀賞植物所組成之群。在進一步具體實例中，該果實係選自於由下列所組成之群：香蕉、鳳梨；柑橘屬植物，包括柑橘類、檸檬、萊姆、葡萄柚及其它柑橘屬植物；葡萄、西瓜、羅馬甜瓜、哈密瓜、及其它甜瓜、蘋果、桃子、梨子、櫻桃、奇異果、芒果、油桃、番石榴、木瓜、柿子、石榴、酪梨、無花果；及漿果，包括草莓、藍莓、覆盆子、黑莓、小漿果及其它型式漿果。在進一步具體實例中，該蔬菜係選自於由下列所組成之群：蕃茄、馬鈴薯、甘薯、樹薯、胡椒、甜椒、胡蘿蔔、芹菜、笋瓜、茄子、甘藍菜、花椰菜、球花甘藍、

蘆筍、磨菇、洋蔥、大蒜、韭蔥及四季豆。進一步具體實例，該花卉或花卉部分係選自於由下列所組成之群：玫瑰花、康乃馨、蘭花、天竺葵、百合花或其它觀賞植物花卉。進一步具體實例，該肉係選自於下列群組：食用牛、野牛、雞、鹿、山羊、火雞、豬肉、羊、魚、貝類、軟體動物或乾醃肉產物。

[0044]在一個具體實例中，該接觸包括藉由選自於由下列所組成之群的方法施加該揮發性抗微生物化合物：噴灑、噴霧、熱或非熱霧化、澆灌、氣體處理及其組合。在進一步具體實例中，該氣體處理係選自於由下列所組成之群：從囊袋釋放、從合成或天然膜、纖維材料釋放、及/或從襯墊或其它包裝材料釋放、從粉末釋放、從氣體釋放產生器釋放、使用壓縮或非壓縮氣瓶釋放、在盒子內從小滴釋放、及其組合。在另一個具體實例中，該方法進一步包括讓該肉類、植物、植物部分與一揮發性植物生長調節劑接觸。在進一步具體實例中，該揮發性植物生長調節劑係一種環丙烯化合物。在進一步具體實例中，該環丙烯化合物包含1-甲基環丙烯(1-MCP)。

[0045]在另一個態樣中，提供一種使用揮發性抗微生物化合物對抗影響肉類、植物或植物部分的病原體之方法。該方法包括讓該肉類、植物或植物部分與有效量的式(VIII)之揮發性抗微生物化合物接觸：



[0046] 其中 R^a 係CN、 $C(O)NR^9R^{10}$ 或 $C(O)OR^{11}$ ，其中 R^{11} 係氫、經取代的烷基或未經取代的烷基；

[0047] X係N、CH及 CR^b ；

[0048] R^b 係鹵素、經取代或未經取代的烷基、 $C(O)R^{12}$ 、 $C(O)OR^{12}$ 、 OR^{12} 、 $NR^{12}R^{13}$ ，其中 R^9 、 R^{10} 、 R^{12} 及 R^{13} 各自獨立地係氫、經取代或未經取代的烷基、經取代或未經取代的雜烷基、經取代或未經取代的環烷基、經取代或未經取代的雜環烷基、經取代或未經取代的芳基、或經取代或未經取代的雜芳基；

[0049] 附帶條件為 R^9 及 R^{10} 選擇性與它們所接附的原子結合，一起形成4至8員經取代或未經取代的雜環烷基環；

[0050] 及附帶條件為 R^{12} 及 R^{13} 選擇性與它們所接附的原子結合，一起形成4至8員經取代或未經取代的雜環烷基環；

[0051] 及其農藝上可接受的鹽。

[0052] 在所提供的方法之一個具體實例中，該病原體係選自於由下列所組成之群：鏈格孢菌、麴菌、葡萄座腔菌、灰黴菌、絲衣黴菌、炭疽刺盤孢菌、色二孢菌、鐮孢菌、地絲菌、毛色二孢菌、鏈核黴菌、毛黴菌、青黴菌、無柄盤菌、擬莖點黴菌、疫病菌、腐黴菌、絲核菌、根黴菌、核盤菌及黑星菌。在另一個具體實例中，該病原體係選自於由下列所組成之群：伊文氏桿菌、果膠桿菌、假單胞菌、

羅爾斯頓氏菌、黃單孢桿菌、沙門氏菌、大腸桿菌、李氏桿菌、芽孢桿菌、志賀氏桿菌及葡萄球菌。在另一個具體實例中，該病原體係選自於由下列所組成之群：念珠菌、德巴利酵母菌、芽孢桿菌、曲狀桿菌、梭狀芽孢桿菌、隱孢子蟲、梨形鞭毛蟲、弧菌及耶爾森氏菌。在另一個具體實例中，該方法包括採集前處理或採集後處理。在進一步具體實例中，該採集前處理係選自於由種子處理及移植處理所組成之群。在另一個具體實例中，該採集後處理係選自於由下列所組成之群：在田野包裝期間處理、在托板輸送期間處理、盒內處理、在運輸期間處理、及在儲存及/或遍及分配網路期間處理。

[0053]在另一個具體實例中，該植物或植物部分包含轉殖基因植物或轉殖基因植物部分。在另一個具體實例中，該植物或植物部分係選自於由玉米、小麥、棉花、米、大豆及油菜所組成之群。在另一個具體實例中，該植物或植物部分係選自於由果實、蔬菜、苗圃、草皮及觀賞植物所組成之群。在進一步具體實例中，該果實係選自於由下列所組成之群：香蕉、鳳梨；柑橘屬植物，包括柑橘類、檸檬、萊姆、葡萄柚及其它柑橘屬植物；葡萄、西瓜、羅馬甜瓜、哈蜜瓜、及其它甜瓜、蘋果、桃子、梨子、櫻桃、奇異果、芒果、油桃、番石榴、木瓜、柿子、石榴、酪梨、無花果；及漿果，包括草莓、藍莓、覆盆子、黑莓、小漿果及其它型式漿果。在進一步具體實例中，該蔬菜係選自於由下列所組成之群：蕃茄、馬鈴薯、甘薯、樹薯、胡椒、



甜椒、胡蘿蔔、芹菜、笋瓜、茄子、甘藍菜、花椰菜、球花甘藍、蘆筍、磨菇、洋蔥、大蒜、韭蔥及四季豆。進一步具體實例，該花卉或花卉部分係選自於由下列所組成之群：玫瑰花、康乃馨、蘭花、天竺葵、百合花或其它觀賞植物花卉。進一步具體實例，該肉係選自於下列群組：食用牛、野牛、雞、鹿、山羊、火雞、豬肉、羊、魚、貝類、軟體動物或乾醃肉產物。

[0054] 在一個具體實例中，該接觸包括藉由選自於由下列所組成之群的方法施加該揮發性抗微生物化合物：噴灑、噴霧、熱或非熱霧化、澆灌、氣體處理及其組合。在進一步具體實例中，該氣體處理係選自於由下列所組成之群：從囊袋釋放、從合成或天然膜釋放、從襯墊或其它包裝材料釋放、從粉末釋放、從氣體釋放產生器釋放、使用壓縮或非壓縮氣瓶釋放、在盒子內從小滴釋放、及其組合。在另一個具體實例中，該方法進一步包括讓該肉類、植物、植物部分與一揮發性植物生長調節劑接觸。在進一步具體實例中，該揮發性植物生長調節劑係一種環丙烯化合物。在進一步具體實例中，該環丙烯化合物包含1-甲基環丙烯(1-MCP)。

【圖式簡單說明】

[0055] 圖1顯示出本發明的範例性化合物A之化學結構。

[0056] 圖2顯示出本發明的範例性化合物B之化學結構。

[0057]圖3顯示出在實施例2中所測試的14種化合物及其各別的最小抑制濃度(MICs)。

[0058]圖4顯示出使用化合物A之範例性活體內抑制結果的典型照片，其中0.04毫克的化合物A顯示出100%抑制及0.0024毫克的化合物A顯示出無抑制。

[0059]圖5顯示出藉由化合物10之揮發性施加，在21°C下處理3天，接著在21°C下額外2天後，灰色葡萄孢菌(*Botrytis cinerea*)的範例性活體內抑制之典型照片。

【實施方式】

較佳實施例之詳細說明

[0060]除非其它方面有描述，否則在本申請案包括專利說明書及申請專利範圍中所使用的下列用語具有下列所提供的定義。必需注意的是，當在專利說明書及附加的申請專利範圍中使用時，除非上下文有明確地指定，否則單一形式“一”、“一種”及“該”包括複數個對象。標準化學用語的定義可在參考著作中找到，包括Carey及Sundberg, *Advanced Organic Chemistry* 4th Ed., Vols. A (2000)及B(2001), Plenum Press, New York, N.Y.。

[0061]如於本文中使用的，措辭“組成部分(moiety)”指為分子的特定片段或官能基。經常識別埋入或附加至分子的化學個體之化學組成部分。

[0062]如於本文中使用的，措辭“雜原子”及“雜-”指為除了碳(C)及氫(H)外的原子。該雜原子的實施例包括氧(O)、氮(N)、硫(S)、矽(Si)、鍺(Ge)、鋁(Al)及硼(B)。

[0063]如於本文中使用的，措辭“鹵基”及“鹵素”可互換及指為氟(-F)、氯(-Cl)、溴(-Br)及碘(-I)。

[0064]如於本文中使用的，措辭“烷基”指為未經取代或經取代的烴基團，及可包括直線、分枝、環狀、飽和及/或不飽和特徵。雖然該烷基組成部分可係“不飽和烷基”組成部分，此意謂著其包括至少一個烯烴或炔烴組成部分，但典型來說，該烷基組成部分係“飽和烷基”，此意謂著其不包含任何烯烴或炔烴組成部分。同樣地，雖然該烷基組成部分可係環狀，但典型來說，該烷基組成部分係非環狀基團。因此，在某些具體實例中，“烷基”指為選擇性經取代的直鏈，或選擇性經取代的枝鏈飽和烴單基團，其在某些具體實例中具有約一至約三十個碳原子，在某些具體實例中約一至約十五個碳原子，及在進一步具體實例中約一至約六個碳原子。該飽和烷基的實施例包括但不限於：甲基、乙基、正丙基、異丙基、2-甲基-1-丙基、2-甲基-2-丙基、2-甲基-1-丁基、3-甲基-1-丁基、2-甲基-3-丁基、2,2-二甲基-1-丙基、2-甲基-1-戊基、3-甲基-1-戊基、4-甲基-1-戊基、2-甲基-2-戊基、3-甲基-2-戊基、4-甲基-2-戊基、2,2-二甲基-1-丁基、3,3-二甲基-1-丁基、2-乙基-1-丁基、丁基、異丁基、二級丁基、三級丁基、正戊基、異戊基、新戊基及正己基；及較長的烷基，諸如庚基及辛基。應注意的是，無論其於本文中何時顯露，數值範圍諸如“1至6”指為在所提供的範圍內之每個整數；例如，“1至6個碳原子”或“C₁₋₆”或“C₁-C₆”意謂著該烷基可由1個碳原子、2個碳原子、3個碳

原子、4個碳原子、5個碳原子及/或6個碳原子組成，然而本定義亦涵蓋無標明出數值範圍的用語“烷基”之事件。

[0065]如於本文中使用的措辭“經取代的烷基”指為如於本文中所定義的烷基，其一或多個(最高約五個，較佳為最高約三個)氫原子由各自獨立地選自於於本文中所定義的取代基之取代基置換。

[0066]如於本文中使用的措辭“取代基”及“經取代”指為可使用來置換在分子上的另一個基團之基團。此基團由熟知化學技藝之人士已知，及可包括一或多種下列經各自獨立地選擇的基團或其所標明出的次小組，但不限制：鹵素、-CN、-OH、-NO₂、-N₃、=O、=S、=NH、-SO₂、-NH₂、-COOH、-S(O₂)、硝基烷基；胺基，包括單及二取代的胺基；氰酸基、異氰酸基、硫氰酸基、異硫氰酸基、胍基、O-胺甲醯基、N-胺甲醯基、胺硫甲醯基、脲基、異脲基、硫脲基、異硫脲基、脲基、硫烷基、亞砷基、砷基、磺醯胺基、膦酸基、磷脂醯基、磷醯胺基、二烷基胺基、二芳基胺基、二芳基烷基胺基；及其經保護的化合物。可形成上述取代基之經保護的化合物之保護基團由熟習該項技術者已知，及可在下列參考資料中找到，諸如 Greene 及 Wuts, *Protective Groups in Organic Synthesis*, 3d Ed., John Wiley & Sons, New York, N.Y. (1999) 及；Kocienski, *Protective Groups*, Thieme Verlag, New York, N.Y., (1994)，其全文以參考之方式併入本文。

[0067]如於本文中使用的措辭“烷氧基”指為-O-烷基，

其中該烷基係如於本文中所定義。在一個具體實例中，該烷氧基包括例如甲氧基、乙氧基、正丙氧基、異丙氧基、正丁氧基、三級丁氧基、二級丁氧基、正戊氧基、正己氧基、1,2-二甲基丁氧基、及其類似基團。該烷氧基可未經取代或經取代。

[0068]如於本文中使用的，措辭“環狀”及“員環”指為任何環狀結構，包括如於本文中描述的脂環族、雜環、芳香族、雜芳香族及多環稠環或非稠環系統。用語“員”意欲指示出構成該環的骨架原子數目。因此，例如，吡啶、哌喃及噻啶係六員環，及吡咯、四氫呋喃及噻吩係五員環。

[0069]如於本文中使用的，措辭“芳香族”指為具有共軛的不飽和 $(4n+2)\pi$ 電子系統(其中 n 係正整數)，有時指為非定域化 π 電子系統之環狀或多環組成部分。

[0070]如於本文中使用的，措辭“芳基”指為六至約二十個環原子之選擇性經取代的芳香族、環狀烴單基團，較佳為六至約十個碳原子及包括稠(或縮合)及非稠環芳香環。該稠芳香環基團包括二至四個稠環，其中該附著的環係芳香環，及在該稠環內的其它各別環可係環烷基、環烯基、環炔基、雜環烷基、雜環烯基、雜環炔基、芳香族、雜芳香族或其任何組合。單環芳基之非為限制的實施例包括苯基；稠環芳基包括萘基、蒽基、薹基；及非稠環雙芳基包括聯苯。

[0071]如於本文中使用的，措辭“經取代的芳基”指為如於本文中所定義的芳基，其一或多個(最高約五個，較佳為最高約三個)氫原子由各自獨立地選自於於本文所定義的群

組之取代基置換(除了如其它方面由對該芳基取代基之定義所約束外)。

[0072]如於本文中使用，措辭“雜芳基”指為包含約五至約二十個骨架環原子之選擇性經取代的芳香族、環狀單基團，較佳為五至約十個環原子及包括稠(或縮合)及非稠環芳香環，及其具有一或多個(一至十個，較佳為約一至約四個)選自於除了碳外的原子之環原子(即，雜原子)，諸如例如，氧、氮、硫、硒、磷或其組合。用語“雜芳基”包括具有至少一個雜原子之選擇性經取代的稠環及非稠環雜芳基。該稠環雜芳基可包含二至四個稠環，其中該附著的環係雜芳香族環及在該稠環系統內的其它各別環可係脂環族、雜環、芳香族、雜芳香族或其任何組合。用語“雜芳基”同樣包括具有五至約十二個骨架環原子的稠環及非稠環雜芳基，和具有五至約十個骨架環原子的那些。該雜芳基的實施例包括但不限於吡啶基、苯并[1,3]二噁嗪、苯并咪唑基、苯并吡啶基、苯并異噁唑基、benzokisazolyl、苯并呋喃基、苯并呋喃基、苯并呋喃基、苯并噻二唑基、苯并噻唑基、苯并[b]噻吩基、苯并噻吩基、苯并噻吩基、苯并三唑基、苯并噁唑基、呋喃基、呋喃基、吡啶基、吡啶基、呋喃基、呋喃基、咪唑基、吡啶基、吡啶基、吡啶基、異苯并呋喃基、異吡啶基、異噁唑基、異噻吩基、異噻吩基、萘啉基(naphthyridinyl)、萘啶基、噁二唑基、噁唑基、吩噁吡基、吩噁吡基、吩噁吡基、吩噁吡基(phenoxathiynyl)、噻吩基、噻吩基、噻吩基、噻吩基

(phenathrolinyl)、吡啶基、蝶啶基、嘧啶基、嘧啶基(puteridinyl)、吡啶基(pyrazyl)、吡啶基(pyrazolyl)、吡啶基(pyridyl)、吡啶基(pyridinyl)、噻吩基、吡啶基、嘧啶基(pyrimidinyl)、嘧啶基(pyrimidyl)、吡咯基、喹啉基、喹啉基、喹啉基、四唑基、噻二唑基、噻唑基、噻吩基、三吡基、(1,2,3)-及(1,2,4)-三唑基及其類似基團，及若適當的話，其氧化物，諸如例如，吡啶基-N-氧化物。

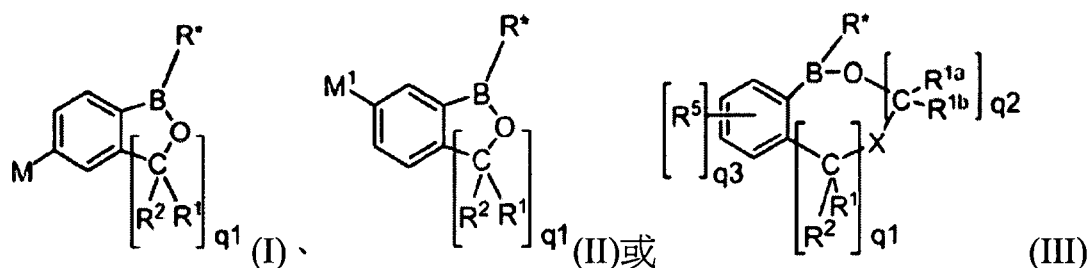
[0073]如於本文中使用的，措辭“經取代的雜芳基”指為如於本文中所定義的雜芳基，其一或多個(最高約五個，較佳為最高約三個)氫原子由各自獨立地選自於於本文中所定義的群組之取代基置換。

[0074]如於本文中使用的，措辭“離去基團”指為具有習知與其在合成有機化學中相關的意義之基團，即，可在取代反應條件下置換之原子或基團。該離去基團的實施例包括但不限於鹵素；烷烴-或伸芳基磺基氧基，諸如甲磺醯氧基、乙磺醯氧基、甲硫基、苯磺基氧基、甲苯磺醯基氧基及噻吩基氧基；二鹵磷醯基氧基、選擇性經取代的苄氧基、異丙氧基、醯氧基及其類似基團。在某些具體實例中，該離去基團可係 HC(O)-COOH 或 RC(O)-COOH ，其中R係 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基或經取代的 $\text{C}_1\text{-C}_6$ 烷基。

[0075]如於本文中所描述之本發明的化合物可使用由熟習該項技術者已知的標準合成技術，或使用在此項技藝中已知之方法與描述於本文的方法組合來合成。使用來合成如描述於本文之本發明的化合物之起始材料可從商業來

源購得，諸如Aldrich Chemical Co.(Milwaukee, Wis.)，Sigma Chemical Co.(St. Louis, Mo.)；或該起始材料可經合成。於本文中所描述的化合物及具有不同取代基的其它相關化合物可使用由熟習該項技術者已知的技術及材料來合成，諸如描述例如在March, *Advanced Organic Chemistry* 4th Ed.(1992) John Wiley & Sons, New York, N.Y.; Carey及Sundberg, *Advanced Organic Chemistry* 4th Ed., Vols. A (2000) 及B(2001) Plenum Press, New York, N.Y.; 及Greene及Wuts, *Protective Groups in Organic Synthesis*, 3rd Ed.(1999) John Wiley & Sons, New York, N.Y., (此全部其全文以參考方式併入本文)。用以製備如揭示於本文的化合物之一般方法可來自在該領域中已知的反應，及該反應可藉由使用如將由熟練的人士所了解之適當試劑及條件，在如於本文所提供的式中引進所發現的不同組成部分而修改。例如，描述於本文的化合物可使用多種親電子基或親核基修改以形成新的官能基或取代基。

[0076] 在某些具體實例中，本發明的揮發性抗微生物化合物具有式(I)、(II)或(III)之結構：



[0077] 其中q₁及q₂各自獨立地係1、2或3；

[0078] q₃=0、1、2、3或4；

[0079] M係氫、鹵素、 $-OCH_3$ 、或 $-CH_2-O-CH_2-O-CH_3$ ；

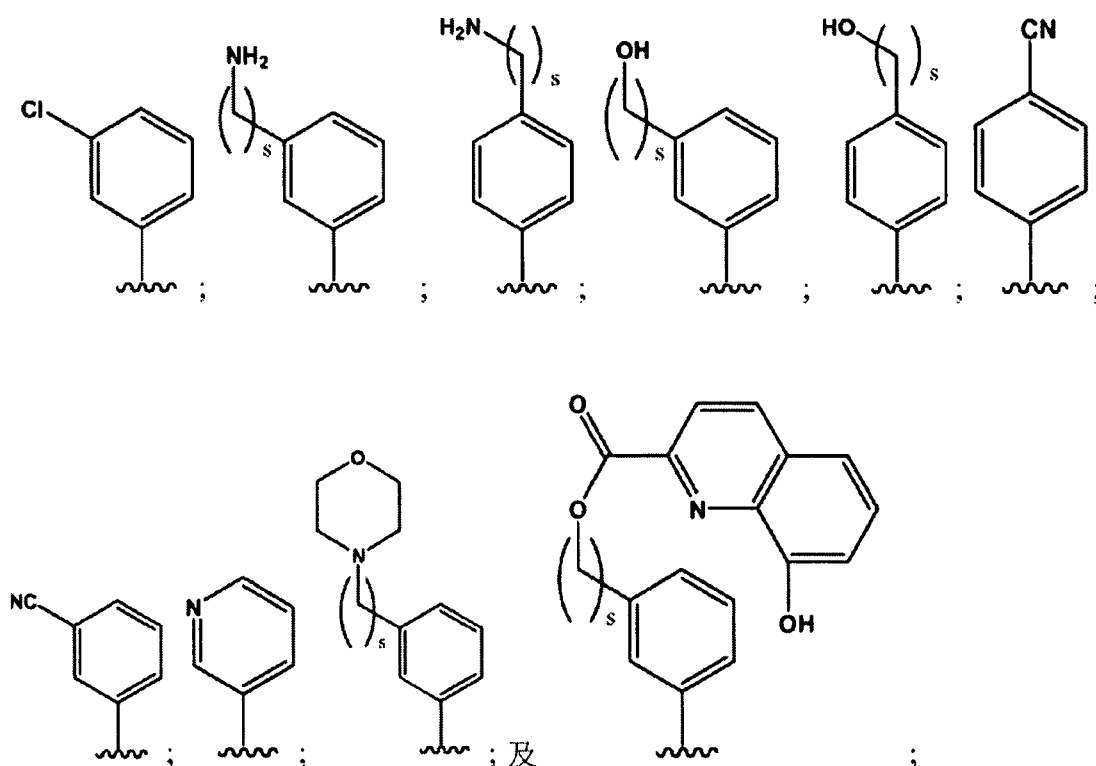
[0080] M^1 係鹵素、 $-CH_2OH$ 、或 $-OCH_3$ ；

[0081] X係O、S或 NR^{1c} ，其中 R^{1c} 係氫、經取代的烷基或未經取代的烷基；

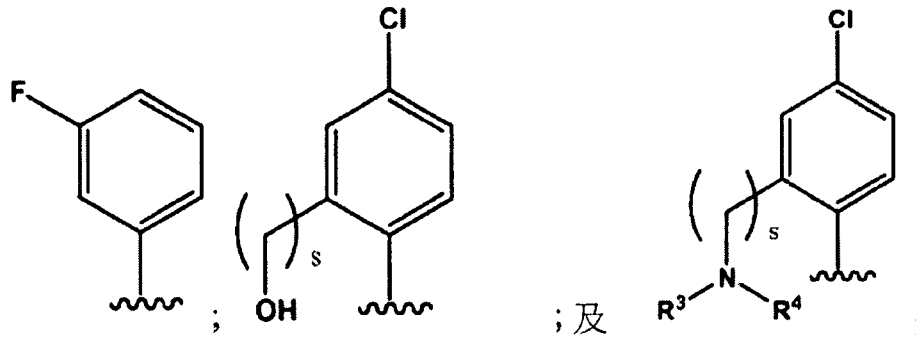
[0082] R^1 、 R^{1a} 、 R^{1b} 、 R^2 及 R^5 各自獨立地係氫、OH、 NH_2 、SH、CN、 NO_2 、 SO_2 、 OSO_2OH 、 OSO_2NH_2 、經取代或未經取代的環烷基、經取代或未經取代的雜環烷基、經取代或未經取代的芳基、或經取代或未經取代的雜芳基；

[0083] R^* 係經取代或未經取代的芳基、經取代或未經取代的芳基烷基、經取代或未經取代的雜芳基、經取代或未經取代的雜芳基烷基、或經取代或未經取代的乙烯基；

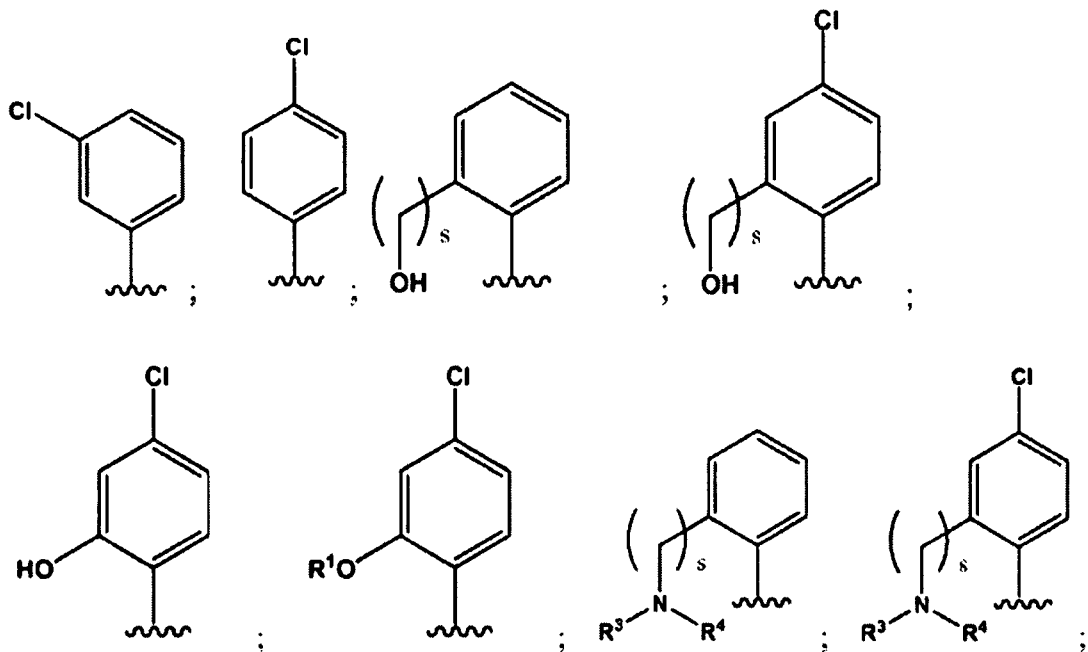
[0084] 附帶條件為當M係F時， R^* 不為選自於下列的成員：

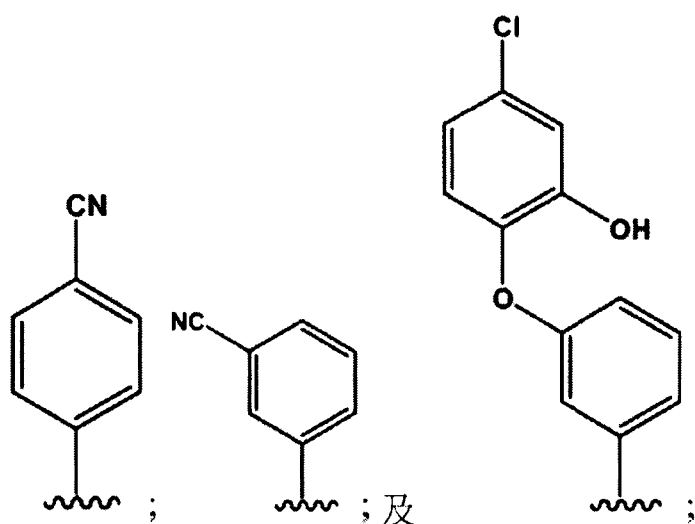


[0085]及附帶條件為當M係Cl時，R*不為選自於下列的成員：



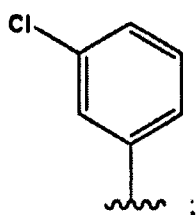
[0086]及附帶條件為當M係氫時，R*不為選自於下列的成員：



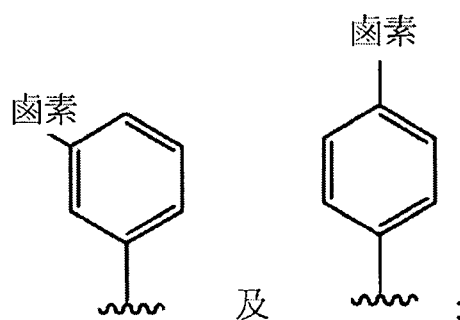


[0087] 其中 $s=1$ 或 2 ；及 R^3 及 R^4 各自獨立地係甲基或乙基；

[0088] 及限制條件為當 M 係 OCH_3 時， R^* 不為選自於下列的成員：

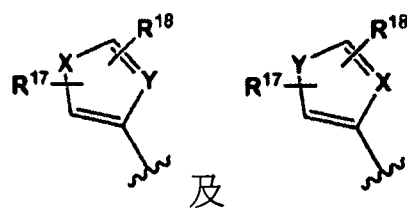


[0089] 及限制條件為當 $M1$ 係 F 時， R^* 不為選自於下列的成員：



[0090] 及其農藝上可接受的鹽。

[0091] 在一個具體實例中，該 R^* 具有選自於下列的結構：



[0092] 其中X係選自於CH=CH、N=CH、NR¹⁴、O及S的成員；

[0093] 其中R¹⁴係選自於H、經取代或未經取代的烷基、經取代或未經取代的芳基、及經取代或未經取代的芳基烷基之成員；

[0094] Y係選自於CH及N的成員；

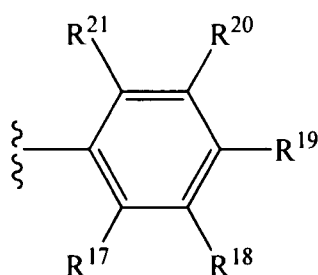
[0095] R¹⁷及R¹⁸係各自獨立地選自於下列的成員：H、經取代或未經取代的烷基、經取代或未經取代的芳基、經取代或未經取代的芳基烷基、(CH₂)_vOH、(CH₂)_wNR¹⁵R¹⁶、CO₂H、CO₂-烷基、CONH₂、S-烷基、S-芳基、SO-烷基、SO-芳基、SO₂-烷基、SO₂-芳基、SO₂H、SCF₂、CN、鹵素、CF₃及NO₂；

[0096] 其中R¹⁵及R¹⁶各自獨立地係選自於氫、經取代或未經取代的烷基及經取代、或未經取代的烷醯基之成員；

[0097] v=1、2或3；及

[0098] w=0、1、2或3。

[0099] 在另一個具體實例中，該R*具有下列結構：



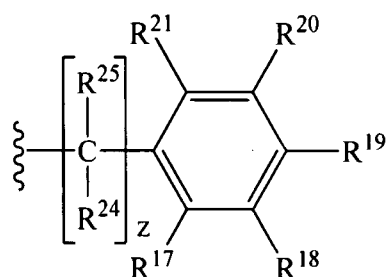
[0100] 其中 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} 、 R^{20} 及 R^{21} 各自獨立地係選自於下列：H、經取代或未經取代的烷基、經取代或未經取代的芳基、經取代或未經取代的芳基烷基、經取代或未經取代的烷氧基、經取代或未經取代的芳氧基、經取代或未經取代的噁唑啉-2-基、 $(CH_2)_tOH$ 、 CO_2H 、 CO_2 -烷基、 $CONH_2$ 、 $CONH$ -烷基、 $CON(烷基)_2$ 、OH、SH、S-烷基、S-芳基、SO-烷基、SO-芳基、 SO_2 -烷基、 SO_2 -芳基、 SO_2H 、 SCF_3 、CN、鹵素、 CF_3 、 NO_2 、 $(CH_2)_uNR^{22}R^{23}$ 、 SO_2NH_2 、 $OCH_2CH_2NH_2$ 、 OCH_2CH_2NH -烷基、及 $OCH_2CH_2N(烷基)_2$ ；

[0101] 其中 $t=1$ 、2或3；

[0102] $u=0$ 、1或2；

[0103] R^{22} 及 R^{23} 各自獨立地係選自於H、經取代或未經取代的烷基、及經取代或未經取代的烷醯基。

[0104] 在另一個具體實例中，該 R^* 具有下列結構：



[0105] 其中 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} 、 R^{20} 及 R^{21} 各自獨立地係選自於H、經取代或未經取代的烷基、經取代或未經取代的芳基、經取代或未經取代的芳基烷基、經取代或未經取代的烷氧基、經取代或未經取代的芳氧基、經取代或未經取代的噁唑啉-2-基、 $(CH_2)_tOH$ 、 CO_2H 、 CO_2 -烷基、 $CONH_2$ 、 $CONH$ -烷基、 $CON(烷基)_2$ 、OH、SH、S-烷基、S-芳基、SO-烷基、

SO-芳基、SO₂-烷基、SO₂-芳基、SO₂H、SCF₃、CN、鹵素、CF₃、NO₂、(CH₂)_uNR²²R²³、SO₂NH₂、OCH₂CH₂NH₂、OCH₂CH₂NH-烷基、及OCH₂CH₂N(烷基)₂；

[0106] 其中t=1、2或3；

[0107] u=0、1或2；

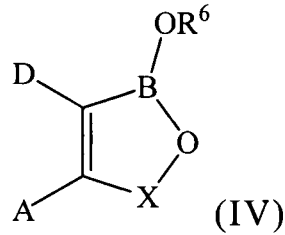
[0108] R²²及R²³各自獨立地係選自於H、經取代或未經取代的烷基、及經取代或未經取代的烷醯基；

[0109] R²⁴及R²⁵各自獨立地係選自於H、經取代或未經取代的烷基、經取代或未經取代的芳基、經取代或未經取代的芳基烷基、經取代或未經取代的烷氧基、經取代或未經取代的芳氧基、經取代或未經取代的噁唑啉-2-基、(CH₂)、OH、CO₂H、CO₂-烷基、CONH₂、CONH-烷基、CON(烷基)₂、OH、SH、S-烷基、S-芳基、SO-烷基、SO-芳基、SO₂-烷基、SO₂-芳基、SO₃H、SCF₃、CN、鹵素、CF₃、NO₂、(CH₂)_uNR²²R²³、SO₂NH₂、OCH₂CH₂NH₂、OCH₂CH₂NH-烷基、及OCH₂CH₂N(烷基)₂；

[0110] Z=1、2、3、4、5或6。

[0111] 額外的抗微生物化合物先前亦揭示在美國專利案號8,106,031及國際專利申請案WO 2007/131072A2中，其內容全文藉此以參考方式併入本文。

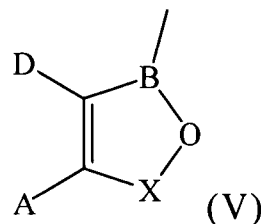
[0112] 在某些具體實例中，本發明之揮發性抗微生物化合物具有式(IV)之結構：



[0113] 其中A及D與它們所接附的碳原子一起形成5、6或7員稠環，其可由下列取代：C₁₋₆-烷基、C₁₋₆-烷氧基、羥基、鹵素、硝基、腓、胺基、經一或多個C₁₋₆-烷基取代的胺基、羧基、醯基、芳氧基、碳醯胺基、經C₁₋₆-烷基取代的碳醯胺基、磺醯胺基或三氟甲基；或該稠環可連結二個氧雜硼環；

[0114] X係-CR⁷R⁸基團，其中R⁷及R⁸每個各自獨立地係氫、C₁₋₆-烷基、腓、硝基、芳基、芳烷基；或R⁷及R⁸與它們所接附的碳原子一起形成脂環族環；及

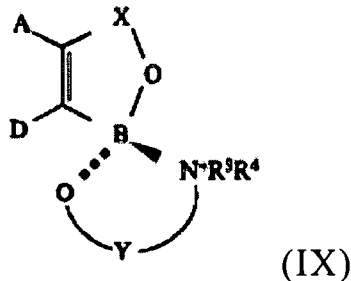
[0115] R⁶係氫、C₁₋₁₈-烷基、(由C₁₋₆-烷氧基取代的C₁₋₁₈-烷基、C₁₋₆-烷硫基、羥基、胺基、經C₁₋₁₈-烷基取代的胺基、羧基、芳基、芳氧基、碳醯胺基、(經C₁₋₆-烷基、芳基或芳烷基取代的碳醯胺基)、芳烷基、芳基、雜芳基、環烷基、C₁₋₁₈-伸烷基胺基；經苯基、C₁₋₆-烷氧基或C₁₋₆-烷硫基取代的C₁₋₁₈-伸烷基胺基；羧基伸烷基胺基或式(V)之基團：



[0116] 其中A、D及X係如先前於本文中所定義，除了硼酞內酯外；

[0117]及其農藝上可接受的鹽。

[0118]在一個具體實例中，本發明之揮發性抗微生物化合物具有式(IX)之結構：

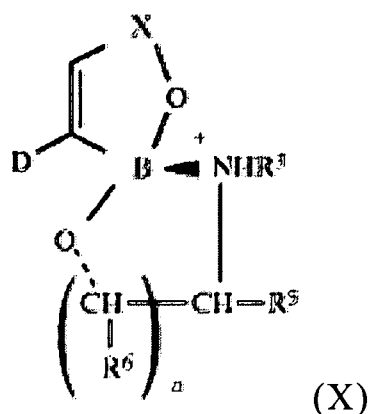


[0119]其中A、D及X係如上述所定義；

[0120]Y係包含最高18個碳原子的二價伸烷基連結基團，或包含最高18個碳原子經苯基、C₁₋₆烷氧基、C₁₋₆-烷硫基取代的二價伸烷基連結基團；羰基伸烷基胺基；及

[0121]R³及R⁴每個各自獨立地係氫、C₁₋₁₈-烷基或苯基；或R³與Y或部分的Y一起形成包含氮原子之5、6或7員環。

[0122]在另一個具體實例中，本發明之揮發性抗微生物化合物具有式(X)之結構：



[0123]其中A、D及X係如上述所定義；

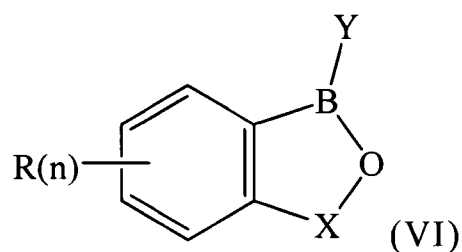
[0124]n係1、2或3；

[0125]R³係氫、C₁₋₁₈-烷基或苯基；及

[0126] R^5 及 R^6 每個各自獨立地係氫、包含最高總共16個碳原子的烷基或苯基。

[0127]額外的抗微生物化合物先前亦揭示在美國專利案號5,880,188中，其內容全文藉此以參考方式併入本文。

[0128]在另一個態樣中，提供一種使用揮發性抗微生物化合物對抗影響肉類、植物或植物部分的病原體之方法。該方法包括讓肉類、植物或植物部分與有效量的式(VI)之揮發性抗微生物化合物接觸：



[0129]其中每個R各自獨立地係氫、烷基、烯烴、炔烴、鹵烷基、鹵烯烴、鹵炔烴、烷氧基、烯氧基、鹵烷氧基、芳基、雜芳基、芳基烷基、芳基烯烴、芳基炔烴、雜芳基烷基、雜芳基烯烴、雜芳基炔烴、鹵素、羥基、腓、胺、酯、羧酸、酮、醇、硫醚、亞砜、砜、磺醯亞胺、磺亞醯胺、磺醯胺、硫酸鹽、磺酸鹽、硝基烷基、醯胺、脞、亞胺、羥胺、胼、脞、胺基甲酸酯、硫代胺基甲酸酯、尿素、硫脲、碳酸鹽、芳氧基或雜芳氧基；

[0130] $n=1$ 、 2 、 3 或 4 ；

[0131] B係硼；

[0132] $X=(CR_2)_m$ ，其中 $m=1$ 、 2 、 3 或 4 ；

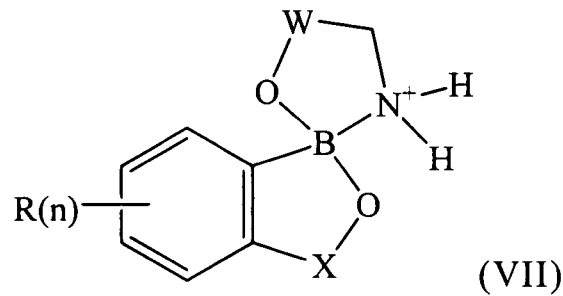
[0133] Y係烷基、烯烴、炔烴、鹵烷基、鹵烯烴、鹵炔

烴、烷氧基、烯氧基、鹵烷氧基、芳基、雜芳基、芳基烷基、芳基烯烴、芳基炔烴、雜芳基烷基、雜芳基烯烴、雜芳基炔烴、羥基、腈、胺、酯、羧酸、酮、醇、硫醚、亞砒、砒、磺醯亞胺、磺亞醯胺、磺醯胺、硫酸鹽、磺酸鹽、硝基烷基、醯胺、胟、亞胺、羥胺、肼、脲、胺基甲酸酯、硫代胺基甲酸酯、尿素、硫脲、碳酸鹽、芳氧基或雜芳氧基；

[0134] 附帶條件為當Y係羥基時，R不為芳氧基或雜芳氧基；

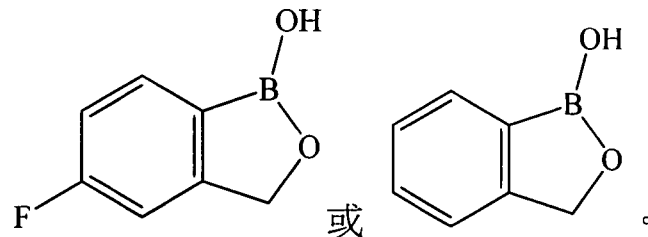
[0135] 及其農藝上可接受的鹽。

[0136] 在一個具體實例中，該揮發性抗微生物化合物具有式(VII)之結構：



[0137] 其中 $W=(CH_2)_q$ ，其中q係1、2或3。

[0138] 在另一個具體實例中，該揮發性抗微生物化合物具有下列結構：



[0139] 在所提供的方法之一個具體實例中，該病原體係選自於由下列所組成之群：鏈格孢菌、麴菌、葡萄座腔菌、

灰黴菌、絲衣黴菌、炭疽刺盤孢菌、色二孢菌、鐮孢菌、地絲菌、毛色二孢菌、鏈核黴菌、毛黴菌、青黴菌、無柄盤菌、擬莖點黴菌、疫病菌、腐黴菌、絲核菌、根黴菌、核盤菌及黑星菌。在另一個具體實例中，該病原體係選自於由下列所組成之群：伊文氏桿菌、果膠桿菌、假單胞菌、羅爾斯頓氏菌、黃單孢桿菌、沙門氏菌、大腸桿菌、李氏桿菌、芽孢桿菌、志賀氏桿菌及葡萄球菌。在另一個具體實例中，該病原體係選自於由下列所組成之群：念珠菌、德巴利酵母菌、芽孢桿菌、曲狀桿菌、梭狀芽孢桿菌、隱孢子蟲、梨形鞭毛蟲、弧菌及耶爾森氏菌。在另一個具體實例中，該方法包括採集前處理或採集後處理。在進一步具體實例中，該採集前處理係選自於由種子處理及移植處理所組成之群。在另一個具體實例中，該採集後處理係選自於由下列所組成之群：在田野包裝期間處理、在托板輸送期間處理、盒內處理、在運輸期間處理、及在儲存及/或遍及分配網路期間處理。

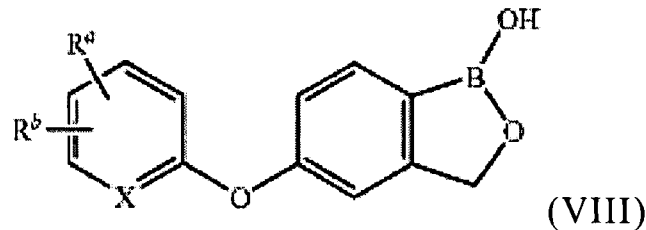
[0140] 在另一個具體實例中，該植物或植物部分包含轉殖基因植物或轉殖基因植物部分。在另一個具體實例中，該植物或植物部分係選自於由玉米、小麥、棉花、米、大豆及油菜所組成之群。在另一個具體實例中，該植物或植物部分係選自於由果實、蔬菜、苗圃、草皮及觀賞植物所組成之群。在進一步具體實例中，該果實係選自於由下列所組成之群：香蕉、鳳梨；柑橘屬植物，包括柑橘類、檸檬、萊姆、葡萄柚及其它柑橘屬植物；葡萄、西瓜、羅馬

甜瓜、哈密瓜、及其它甜瓜、蘋果、桃子、梨子、櫻桃、奇異果、芒果、油桃、番石榴、木瓜、柿子、石榴、酪梨、無花果；及漿果，包括草莓、藍莓、覆盆子、黑莓、小漿果及其它型式漿果。在進一步具體實例中，該蔬菜係選自於由下列所組成之群：蕃茄、馬鈴薯、甘薯、樹薯、胡椒、甜椒、胡蘿蔔、芹菜、笋瓜、茄子、甘藍菜、花椰菜、球花甘藍、蘆筍、磨菇、洋蔥、大蒜、韭蔥及四季豆。進一步具體實例，該花卉或花卉部分係選自於由下列所組成之群：玫瑰花、康乃馨、蘭花、天竺葵、百合花或其它觀賞植物花卉。進一步具體實例，該肉係選自於下列群組：食用牛、野牛、雞、鹿、山羊、火雞、豬肉、羊、魚、貝類、軟體動物或乾醃肉產物。

[0141]在一個具體實例中，該接觸包括藉由選自於由下列所組成之群的方法施加該揮發性抗微生物化合物：噴灑、噴霧、熱或非熱霧化、澆灌、氣體處理及其組合。在進一步具體實例中，該氣體處理係選自於由下列所組成之群：從囊袋釋放、從合成或天然膜、纖維材料釋放、及/或從襯墊或其它包裝材料釋放、從粉末釋放、從氣體釋放產生器釋放、使用壓縮或非壓縮氣瓶釋放、在盒子內從小滴釋放、及其組合。在另一個具體實例中，該方法進一步包括讓該肉類、植物、植物部分與一種環丙烯化合物接觸。在進一步具體實例中，該環丙烯化合物包含1-甲基環丙烯(1-MCP)。

[0142]在另一個態樣中，提供一種使用揮發性抗微生物

化合物對抗影響肉類、植物或植物部分的病原體之方法。
該方法包括讓該肉類、植物或植物部分與有效量的式(VIII)
之揮發性抗微生物化合物接觸：



[0143] 其中 R^a 係CN、 $C(O)NR^9R^{10}$ 或 $C(O)OR^{11}$ ，其中 R^{11} 係氫、經取代的烷基、或未經取代的烷基；

[0144] X係N、CH及 CR^b ；

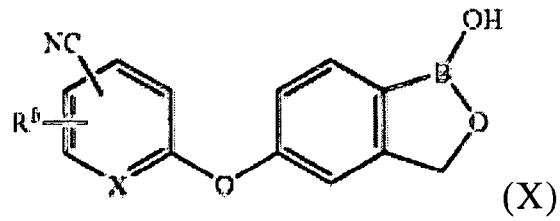
[0145] R^b 係鹵素、經取代或未經取代的烷基、 $C(O)R^{12}$ 、 $C(O)OR^{12}$ 、 OR^{12} 、 $NR^{12}R^{13}$ ，其中 R^9 、 R^{10} 、 R^{12} 及 R^{13} 各自獨立地係氫、經取代或未經取代的烷基、經取代或未經取代的雜烷基、經取代或未經取代的環烷基、經取代或未經取代的雜環烷基、經取代或未經取代的芳基、或經取代或未經取代的雜芳基；

[0146] 附帶條件為 R^9 及 R^{10} 選擇性與它們所接附的原子結合，一起形成4至8員經取代或未經取代的雜環烷基環；

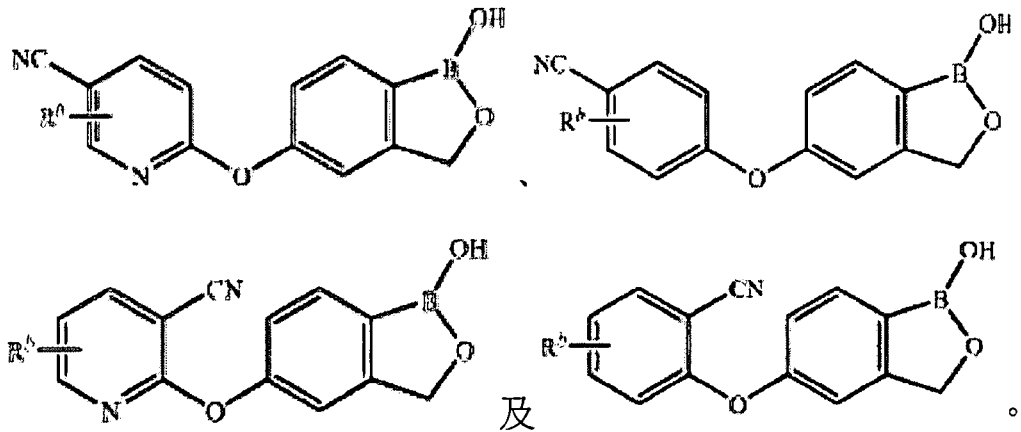
[0147] 及附帶條件為 R^{12} 及 R^{13} 選擇性與它們所接附的原子結合，一起形成4至8員經取代或未經取代的雜環烷基環；

[0148] 及其農藝上可接受的鹽。

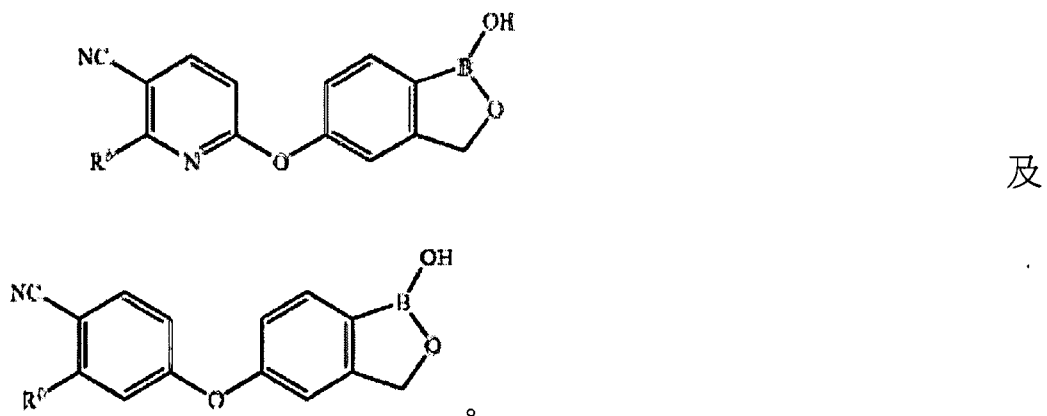
[0149] 在一個具體實例中，本發明之揮發性抗微生物化合物具有式(X)之結構：



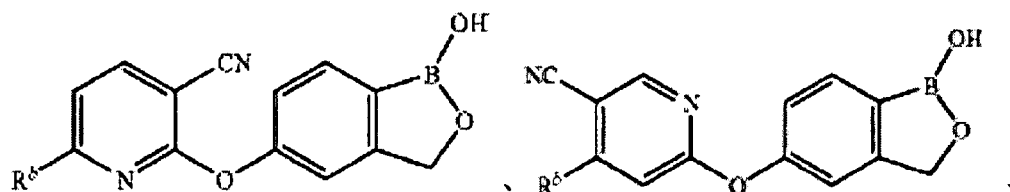
[0150] 在另一個具體實例中，本發明之揮發性抗微生物化合物係選自於：

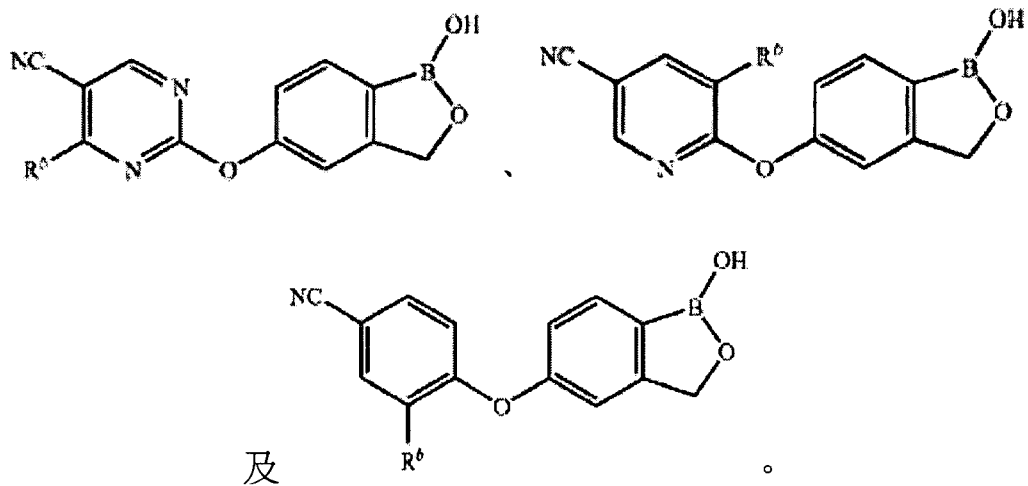


[0151] 在另一個具體實例中，本發明之揮發性抗微生物化合物係選自於：

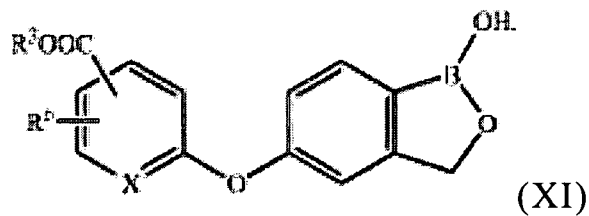


[0152] 在另一個具體實例中，本發明之揮發性抗微生物化合物係選自於：

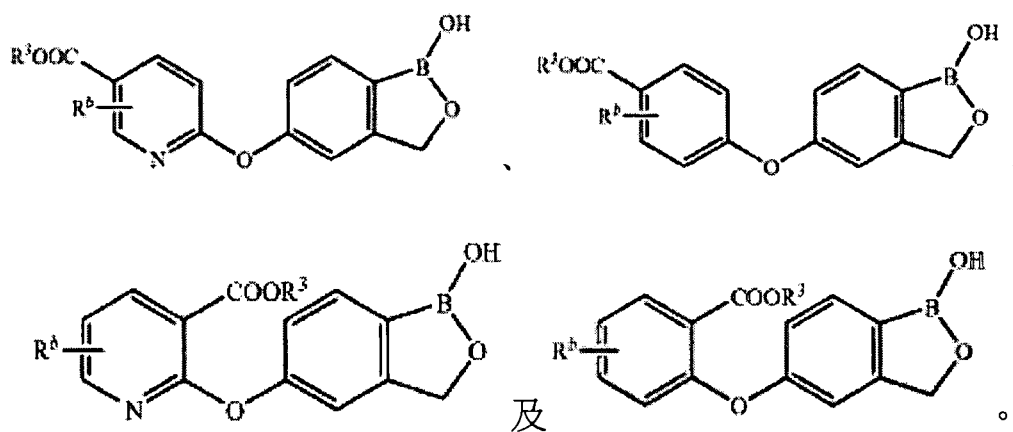




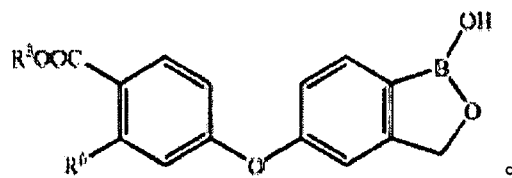
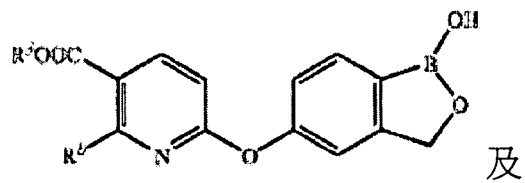
[0153] 在一個具體實例中，本發明之揮發性抗微生物化合物具有式(XI)之結構：



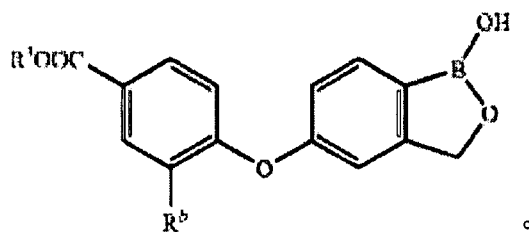
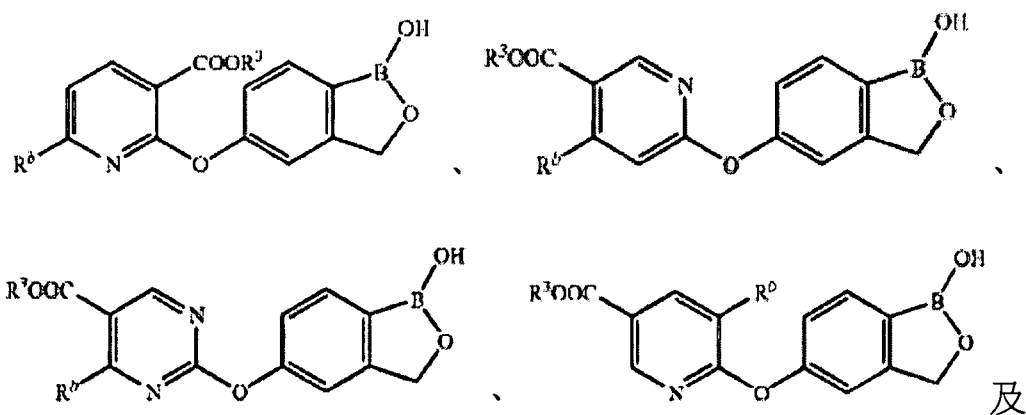
[0154] 在另一個具體實例中，本發明之揮發性抗微生物化合物係選自於：



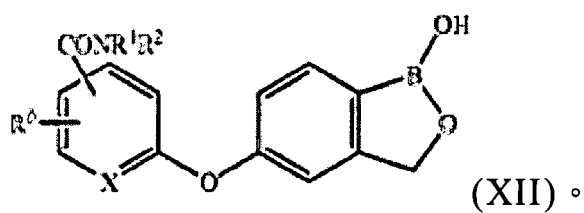
[0155] 在另一個具體實例中，本發明之揮發性抗微生物化合物係選自於：



[0156] 在另一個具體實例中，本發明之揮發性抗微生物化合物係選自於：

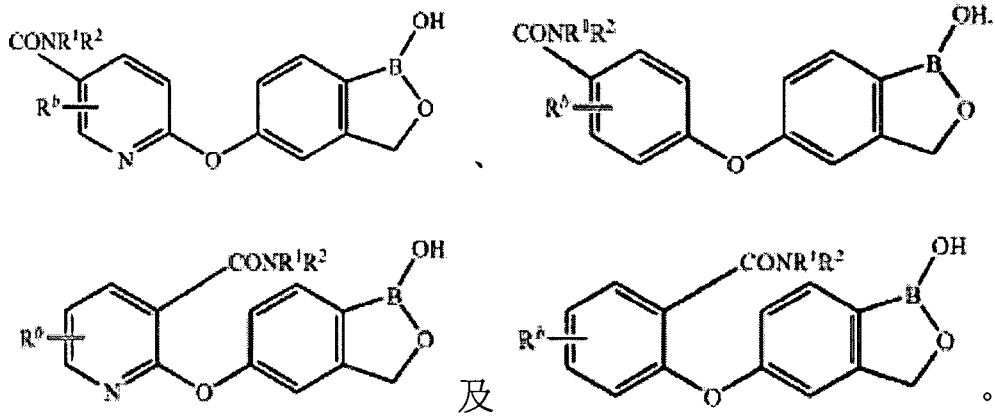


[0157] 在一個具體實例中，本發明之揮發性抗微生物化合物具有式(XII)之結構：

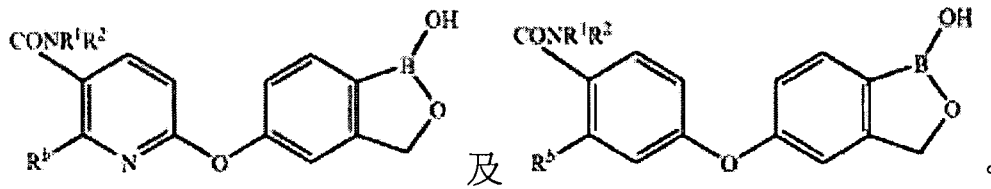


[0158] 在另一個具體實例中，本發明之揮發性抗微生物

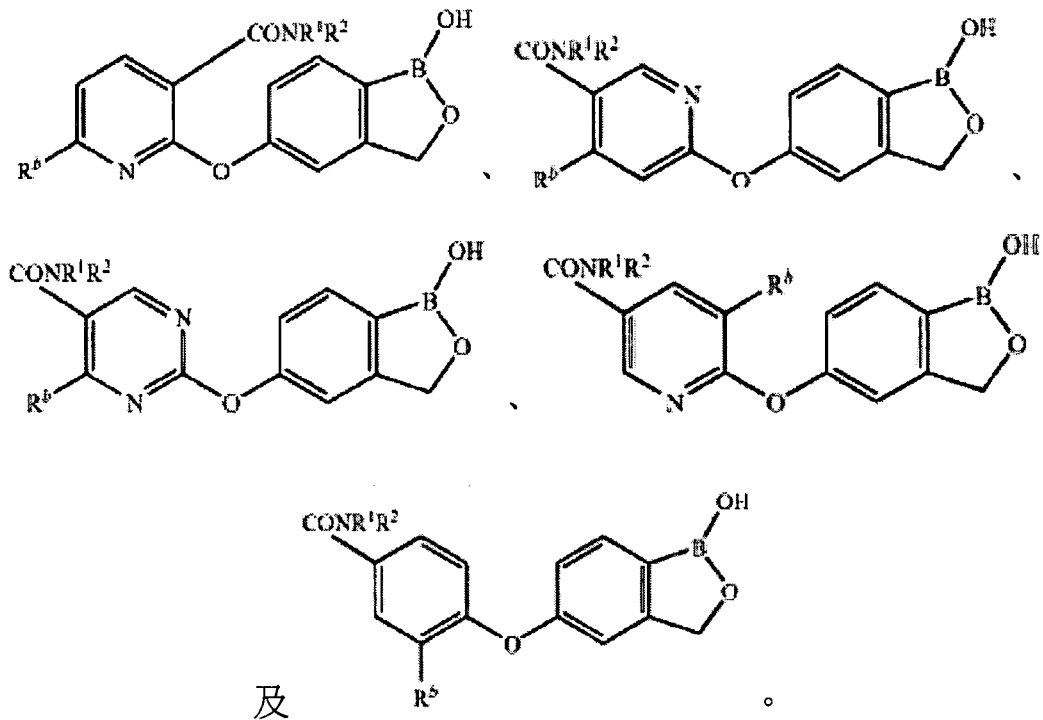
化合物係選自於：



[0159] 在另一個具體實例中，本發明之揮發性抗微生物化合物係選自於：

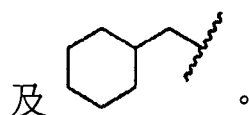


[0160] 在另一個具體實例中，本發明之揮發性抗微生物化合物係選自於：



[0161] 在一個具體實例中， R^b 係選自於氟及氫。在另一個具體實例中， R^b 係選自於 OR^{26} 及 $NR^{27}R^{28}$ 。在另一個具體實例中，當 R^b 係 OR^{26} 時， R^{26} 係選自於H、經取代或未經取代的烷基、經取代或未經取代的雜烷基、經取代或未經取代的環烷基、經取代或未經取代的雜環烷基、經取代或未經取代的芳基、及經取代或未經取代的雜芳基。在另一個具體實例中，當 R^b 係 OR^{26} 時， R^{26} 係選自於H、經取代或未經取代的烷基、經取代或未經取代的雜烷基、及經取代或未經取代的環烷基。在另一個具體實例中，當 R^b 係 OR^{26} 時， R^{26} 係未經取代 C_{1-6} 烷基。在另一個具體實例中，當 R^b 係 OR^{26} 時， R^{26} 係未經取代的環烷基。在另一個具體實例中，當 R^b 係 OR^{26} 時， R^{26} 係經選自於經取代或未經取代的 C_{1-6} 烷氧基之成員取代的烷基。在另一個具體實例中，當 R^b 係 OR^{26} 時， R^{26} 係經至少一個鹵素取代的烷基。在另一個具體實例中，當 R^b 係 OR^{26} 時， R^{26} 係經至少一個側氧組成部分取代的烷基。

[0162] 在另一個具體實例中，當 R^b 係 OR^{26} 時， R^{26} 係選自於下列的成員： $-CH_3$ 、 $-CH_2CH_3$ 、 $-(CH_2)_2CH_3$ 、 $-CH(CH_3)_2$ 、 $-CH_2CF_3$ 、 $-CH_2CHF_2$ 、 $-CH_2CH_2(OH)$ 、 $-CH_2CH_2(OCH_3)$ 、 $-CH_2CH_2(OC(CH_3)_2)$ 、 $-C(O)CH_3$ 、 $-CH_2CH_2OC(O)CH_3$ 、 $-CH_2C(O)OCH_2CH_3$ 、 $-CH_2C(O)OC(CH_3)_3$ 、 $-(CH_2)_3C(O)CH_3$ 、 $-CH_2C(O)OC(CH_3)_3$ 、環戊基、環己基、

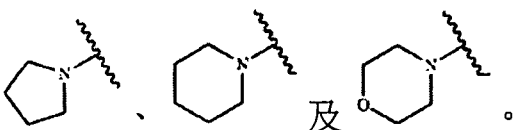


[0163] 在另一個具體實例中，當 R^b 係 $NR^{27}R^{28}$ 時， R^{27} 及 R^{28} 係各自獨立地選自於下列的成員：H、經取代或未經取代的烷基、經取代或未經取代的雜烷基、經取代或未經取代的環烷基、經取代或未經取代的雜環烷基、經取代或未經取代的芳基、及經取代或未經取代的雜芳基。在另一個具體實例中，當 R^b 係 $NR^{27}R^{28}$ 時， R^{27} 係H或未經取代的烷基；及 R^{28} 係未經取代的烷基、或經選自於羥基、苯基的成員取代之烷基、未經取代的烷氧基及經苯基取代的烷氧基。在進一步具體實例中，當 R^b 係 $NR^{27}R^{28}$ 時， R^{27} 係H或 CH_3 。

[0164] 在另一個具體實例中，當 R^b 係 $NR^{27}R^{28}$ 時， R^{27} 及 R^{28} 各自獨立地係選自於經取代或未經取代的烷基。在另一個具體實例中，當 R^b 係 $NR^{27}R^{28}$ 時， R^{27} 係未經取代的烷基；及 R^{28} 係經取代或未經取代的烷基。在另一個具體實例中，當 R^b 係 $NR^{27}R^{28}$ 時， R^{27} 係未經取代的烷基；及 R^{28} 係經選自於經取代或未經取代的烷氧基及羥基之成員取代之烷基。在另一個具體實例中，當 R^b 係 $NR^{27}R^{28}$ 時， R^{27} 係未經取代的烷基；及 R^{28} 係經未經取代烷氧基取代之烷基。在另一個具體實例中，當 R^b 係 $NR^{27}R^{28}$ 時， R^{27} 係未經取代的烷基；及 R^{28} 係經烷氧基取代、經苯基取代的烷基。在另一個具體實例中，當 R^b 係 $NR^{27}R^{28}$ 時， R^{27} 係未經取代的烷基；及 R^{28} 係經未經取代的烷氧基取代之烷基。在另一個具體實例中，當 R^b 係 $NR^{27}R^{28}$ 時， R^{27} 及 R^{28} 與它們所接附的氮結合，一起形成4至8員經取代或未經取代的雜環烷基環。在另一個具體實例中，當 R^b 係 $NR^{27}R^{28}$ 時， R^{27} 及 R^{28} 與它們所接附的氮

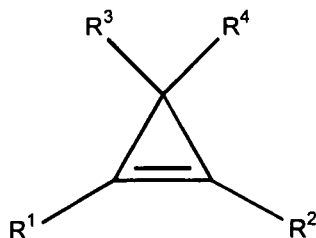
結合，一起形成5或6員經取代或未經取代的雜環烷基環。

[0165]在另一個具體實例中， R^b 係選自於 $N(CH_3)_2$ 、 $N(CH_3)(CH_2CH_2(OCH_3))$ 、 $N(CH_3)(CH_2CH_2OH)$ 、 NH_2 、 $NHCH_3$ 、 $NH(CH_2CH_2(OCH_3))$ 、 $NH(CH_2CH_2(OCH_2Ph))$ 、 $NH(CH_2Ph)$ 、 $NH(C(CH_3)_3)$ 及 $NH(CH_2CH_2OH)$ 。在另一個具體實例中， R^b

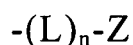
係選自於 。

[0166]額外的抗微生物化合物先前亦揭示在美國專利案號8,039,450及專利申請案公告美國2009/0291917中，此內容其全文藉此以參考方式併入本文。

[0167]本發明的實施包括使用一或多種環丙烯化合物。如於本文中使用的，該環丙烯化合物係具有下式之任何化合物：



其中 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 每個各自獨立地係選自於由H及下式之化學基團所組成之群：



其中n係整數0至12。每個L係二價基團。合適的L基團包括例如包含一或多個選自於H、B、C、N、O、P、S、Si的原子、或其混合物之基團。在L基團內的原子可藉由單鍵、雙鍵、三鍵或其混合物彼此連接。每個L基團可係線性、分枝、

環狀或其組合。在任何一個R基團(即, R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 之任何一個)中, 該雜原子(即, 非H或C之原子)的總數目係0至6。在任何一個R基團中, 非氫原子的總數目各自獨立地係50或較少。每個Z係單價基團。每個Z各自獨立地係選自於由下列所組成之群: 氫、鹵基、氰基、硝基、亞硝基、疊氮基、氰酸鹽、溴酸鹽、碘酸鹽、異氰酸基、異腈基、異硫氰酸基、五氟硫基、及化學基團G, 其中G係3至14員環系統。

[0168] 該 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 基團各自獨立地係選自於合適的基團。在該等基團當中, 合適於使用作為 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 之一或多種的有例如脂肪族基團、脂肪族-氧基、烷基膦酸基、環脂族基團、環烷基砒基、環烷基胺基、雜環基團、芳基、雜芳基、鹵素、矽烷基、其它基團、及其混合物及組合。合適於使用作為 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 之一或多種的基團可經取代或未經取代。

[0169] 在此當中, 該合適的 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 基團有例如脂肪族基團。某些合適的脂肪族基團包括例如烷基、烯基及炔基。合適的脂肪族基團可係線性、分枝、環狀或其組合。合適的脂肪族基團可各自獨立地係經取代或未經取代。

[0170] 如於本文中使用的, 若該有興趣的化學基團之一或多個氫原子係由取代基置換時, 該有興趣的化學基團可說成係“經取代”。

[0171] 同樣地在此當中, 合適的 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 基團有例如經取代及未經取代的雜環基, 其係經由介於中間的氧

基、胺基、羰基或砒基連接至該環丙烯化合物；此 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 基團的實施例有雜環基氧基、雜環基羰基、二雜環基胺基及二雜環基胺基砒基。

[0172]同樣地在此當中，該合適的 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 基團有例如經取代及未經取代的雜環基團，其係經由介於中間的氧基、胺基、羰基、砒基、硫烷基或胺基砒基連接至該環丙烯化合物；此 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 基團的實施例有二雜芳基胺基、雜芳硫基烷基及二雜芳基胺基砒基。

[0173]同樣地在此當中，該合適的 R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 基團有例如氫、氟、氯、溴、碘、氰基、硝基、亞硝基、疊氮基、氰酸基、溴酸基、碘酸基、異氰酸基、異腈基、異硫氰酸基、五氟硫基；乙醯氧基、乙氧甲醯基、氰酸基、硝酸基、亞硝酸基、過氧酸基、丙二烯基、丁基巯基、二乙基膦酸基、二甲基苯基矽烷基、異喹啉基、巯基、萘基、苯氧基、苯基、吡啶基、吡啶基、喹啉基、三乙基矽烷基、三甲基矽烷基；及其經取代的類似基團。

[0174]如於本文中使用的，該化學基團G係3至14員環系統。合適作為化學基團G的環系統可經取代或未經取代；它們可係芳香族(包括例如，苯基及萘基)或脂肪族(包括不飽和脂肪族、部分飽和脂肪族、或飽和脂肪族)；及它們可係碳環或雜環。在雜環G基團當中，某些合適的雜原子有例如氮、硫、氧及其組合。合適作為化學基團G的環系統可係單環、雙環、三環、多環、螺或稠環；在係雙環、三環或稠環的合適化學基團G環系統當中，於單一化學基團G中的多

個環可係全部相同型式或可係二或更多種型式(例如，芳香環可與脂肪族環稠合)。

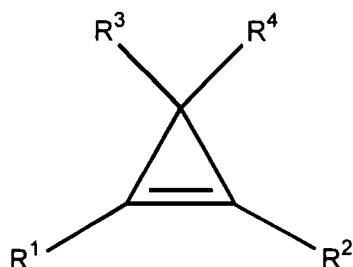
[0175] 在一個具體實例中， R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 之一或多個係氫或(C₁-C₁₀)烷基。在另一個具體實例中， R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 每個係氫或(C₁-C₈)烷基。在另一個具體實例中， R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 每個係氫或(C₁-C₄)烷基。在另一個具體實例中， R^1 、 R^2 、 R^3 及 R^4 每個係氫或甲基。在另一個具體實例中， R^1 係(C₁-C₄)烷基，及 R^2 、 R^3 及 R^4 每個係氫。在另一個具體實例中， R^1 係甲基，及 R^2 、 R^3 及 R^4 每個係氫，及該環丙烯化合物於本文中已知為1-甲基環丙烯或“1-MCP”。

[0176] 在另一個具體實例中，該環丙烯具有下式：



其中R係經取代或未經取代的烷基、烯基、炔基、環烷基、環烷基烷基、苯基或萘基；其中該取代基各自獨立地係鹵素、烷氧基、或經取代或未經取代的苯氧基。在一個具體實例中，R係C₁₋₈烷基。在另一個具體實例中，R係甲基。

[0177] 在另一個具體實例中，該環丙烯具有下式：



其中 R^1 係經取代或未經取代的C₁-C₄烷基、C₁-C₄烯基、C₁-C₄炔基、C₁-C₄環烷基、環烷基烷基、苯基或萘基；及 R^2 、 R^3

及R⁴係氫。在另一個具體實例中，該環丙烯包含1-甲基環丙烯(1-MCP)。

[0178]如於本文中使用的措辭“轉殖基因載體”指為包括DNA的插入片段之載體，該“轉殖基因”係在宿主細胞內轉錄進mRNA中或複製成RNA。措辭“轉殖基因”不僅指為該轉換成RNA之插入的DNA之部分，而且亦指為該載體對該RNA之轉錄或複製所必需的那些部分。該轉殖基因典型包括有興趣的基因，但是需要非必然地包含一包括能產生蛋白質的開放讀碼區之多核苷酸序列。

[0179]肉類、植物或植物部分可在本發明之實施中處理。一個實施例係整株植物之處理；另一個實施例係當它們種植在土壤中時，在採集有用的植物部分前之整株植物處理。

[0180]可在本發明的實施中處理提供有用的植物部分之任何植物。其實施例包括提供果實、蔬菜及穀粒的植物。

[0181]如於本文中使用的措辭“植物”包括雙子葉植物及單子葉植物。該雙子葉植物的實施例包括煙草、阿拉伯芥屬(*Arabidopsis*)、大豆、蕃茄、木瓜、油菜、向日葵、棉花、紫花苜蓿、馬鈴薯、葡萄藤、樹豆、豌豆、蕓薹屬(*Brassica*)、雞豆、甜菜、油菜籽、西瓜、甜瓜、胡椒、花生、南瓜(*pumpkin*)、蘿蔔、菠菜、笋瓜、球花甘藍、甘藍菜、胡蘿蔔、花椰菜、芹菜、大白菜、黃瓜、茄子及萵苣。該單子葉植物的實施例包括玉米、米、小麥、甘蔗、大麥、黑麥、高粱、蘭花、竹、香蕉、香蒲、百合、燕麥、洋蔥、粟及黑小麥。該果實的實施例包括香蕉、鳳梨、柑橘類、葡萄、葡萄柚、西

瓜、甜瓜、蘋果、桃子、梨子、奇異果、芒果、油桃、番石榴、柿子、酪梨、檸檬、無花果及漿果。

[0182] 熟習該項技術者將了解可根據所提供的揭示存在有某些變化。因此，提供下列實施例用於闡明本發明之目的而不應該解釋為限制本發明的範圍或申請專利範圍。

實施例

實施例1

[0183] 使用12井(每井7毫升體積)微滴板用於揮發性抗微生物化合物的試管內抑制試驗。對每井加入3毫升體積之全強度馬鈴薯右旋糖瓊脂(PDA)。在冷卻後，將1微升之每毫升 1×10^6 灰色葡萄孢菌孢子懸浮液點吸移至瓊脂中心。對第一實驗來說，允許已接種的板在 4°C 下發芽5天。對第二實驗來說，在揮發性殺黴菌劑處理前，立即接種該板。將小的Whatman #1過濾盤(目錄編號1001-0155)放置在聚乙烯PCR板密封膜的底面上，一式二份。為了測量最小抑制濃度(MIC)，在丙酮中稀釋化合物A(苯并氧雜硼；圖1)，及以劑量相依的方式將適當量的化合物加入至盤(1.25至0.0006毫克/盤)。准許該丙酮蒸發5分鐘。然後，藉由該膜將繞著灰色葡萄孢菌接種體的頂端空間與包含該殺黴菌劑的黏附盤密封在該井內。倒置該板，將其放在經處理的盤上及密封以防止任何化學藥品從盤剝脫及落到該經接種的瓊脂上。在 4°C 下儲存14天後，評估培養物相對於對照的生長百分比。不管該孢子是已經發芽5天或是在該板接種後不久(~15分鐘)開始處理，該真菌病原體係100%向下控制至0.005毫克。實驗結果總整理在表1中。結果建議化合物A能夠在相同濃

度下殺死灰色葡萄孢菌孢子及抑制菌絲生長。因此，化合物A(圖1)顯示出在真菌生長之試管內抑制中於0.005毫克/盤的比例下有100%效力。

化合物A的比例(每盤毫克)	灰黴菌屬抑制%(試管內)
1.25	100%
0.63	100%
0.31	100%
0.16	100%
0.08	100%
0.04	100%
0.023	100%
0.01	100%
0.005	100%
0.0024	85%
0.001	69%
0.0006	46%
對照	0%

實施例2

[0184] 使用在實施例1中所描述的試管內抑制試驗來測試總共14種抗微生物化合物。以劑量相依的方式(0.31至0.0006毫克/盤)將全部14種化合物施加至Whatman盤，一式二份。結果顯示出X11820679(化合物A)提供灰色葡萄孢菌有最好的控制，其具有100%控制向下至0.005毫克/盤。其它化合物諸如X11820681、X11820683及X11820684各別授予100%控制向下至0.023、0.04及0.08毫克/盤。所測試的化合物及其各別的MICs係顯示在圖3中。九種化合物的結果係總整理在表2中，其中其它五種化合物顯示出在所測試的範

圍內無偵測到活性。

表2. 揮發性殺黴菌劑的試管內試驗之結果，以灰黴菌屬抑制%計

比例 (毫克/盤)	化合物 A	化合物 C	化合物 D	化合物 E	化合物 F	化合物 G	化合物 H	化合物 J	化合物 K
0.31	100%	100%	100%	100%	70%	100%	85%	50%	48%
0.16	100%	100%	100%	100%	53%	78%	80%	13%	29%
0.08	100%	100%	100%	100%	40%	43%	55%	8%	5%
0.04	100%	100%	100%	79%	18%	13%	38%	5%	0%
0.023	100%	100%	80%	79%	10%	3%	18%	0%	0%
0.01	100%	83%	70%	69%	8%	0%	3%	0%	0%
0.005	100%	63%	38%	38%	8%	0%	0%	0%	0%
0.0024	85%	43%	15%	28%	0%	0%	0%	0%	0%
0.001	69%	15%	0%	13%	0%	0%	0%	0%	0%
0.0006	46%	0%	0%	13%	0%	0%	0%	0%	0%
對照	0%	0%	0%	0%	0%	0%	0%	0%	0%

實施例3

[0185]使用類似於如在上述實施例1及2中所描述的方式來評估化合物B(圖2；2-(羥甲基)苯基硼酸環狀單酯，脫氟(des-fluoro)類似物X11820679)。以0.5毫克至0.0039毫克/盤的比例將該等化合物施加至Whatman濾紙。結果顯示出化合物B在0.0078毫克/盤的比例下抑制100%灰色葡萄孢菌。

實施例4

[0186]爲了評估揮發性抗微生物化合物的活體內活性，使用綠色鮮食葡萄(table grape)展開揮發性生物鑑定。將果實各別放置在20毫升閃爍小玻璃瓶內且梗傷口面向上。該新

鮮的梗傷口係以10微升的每毫升 1×10^6 灰色葡萄孢菌孢子懸浮液接種。將Whatman濾紙(目錄編號1822-024)放在成雙的小玻璃瓶蓋內。爲了測量MIC，化合物A(圖1)係在丙酮中稀釋，且以劑量相依的方式(2.5至0.0024毫克/盤)將適當量的化合物加入至盤。准許該丙酮蒸發5分鐘。然後，以包含該殺黴菌劑的蓋子覆蓋該小玻璃瓶且放置在4°C下14天。在儲存後，評估果實的疾病發生率及植物毒性之顯露。結果總整理在表3中及灰色葡萄孢菌100%控制向下至0.04毫克/盤，且在所評估的任何比例下無植物毒性證據。使用化合物A的範例性活體內抑制結果之典型照片係顯示在圖4中，其中0.04毫克的化合物A顯示出100%抑制及0.0024毫克的化合物A顯示出無抑制。

化合物A的比例(每盤的毫克數)	灰黴菌屬抑制%(試管內)
1.25	100%
0.63	100%
0.31	100%
0.16	100%
0.08	100%
0.04	100%
0.023	0%
0.01	0%
0.005	0%
0.0024	0%
對照	0%

實施例5

[0187] 爲了評估揮發性抗微生物化合物的活體內活性，使用草莓展開揮發性生物鑑定。將二顆果實放在240毫升廣口瓶內且花萼面向下。新鮮的傷口係以20微升之每毫升 1×10^6 灰色葡萄孢菌孢子懸浮液接種。將Whatman濾紙(目錄編號1822-024)放在成雙的廣口瓶蓋內。爲了測量MIC，化合物A(苯并氧雜硼；圖1)係在丙酮中稀釋，且以劑量相依的方式(2.5至0.005毫克/盤)將適當量之化合物加入至盤。爲了測量MIC，化合物B(苯并氧雜硼；圖2)係在丙酮中稀釋，且以劑量相依的方式(2.5至0.005毫克/盤)將適當量的化合物加入至盤。准許該丙酮蒸發5分鐘。然後，以包含殺黴菌劑的蓋子覆蓋該廣口瓶且放置在21°C下5天。在儲存後，評估果實的疾病發生率及嚴重性與植物毒性之顯露。結果總整理在表4中。二者化合物A對灰色葡萄孢菌100%控制向下至0.16毫克/盤，及二者化合物B對灰色葡萄孢菌100%控制向下至0.32毫克/盤，及在所評估的任何比例下無植物毒性證據。

表4. 灰色葡萄孢菌發生率(%)

比例，毫克/盤	化合物A	化合物B
0.005	75 %	100 %
0.01	100 %	100 %
0.02	100 %	100 %
0.04	50 %	75 %
0.08	75 %	50 %
0.16	0 %	25 %

0.32	0 %	0 %
0.64	0 %	0 %
1.25	0 %	0 %
2.5	0 %	0 %

實施例6

[0188] 爲了藉由揮發性抗微生物化合物之時間活性來評估活體內劑量，使用草莓展開揮發性生物鑑定。將二顆果實放在240毫升廣口瓶內且花萼面向下。新鮮的傷口係以20微升的每毫升 1×10^6 灰色葡萄孢菌孢子懸浮液接種。將Whatman濾紙(目錄編號1822-024)放在成雙廣口瓶蓋內。化合物A(苯并氧雜硼；圖1)係在丙酮中稀釋，及以二種比例0.008或0.125毫克將適當量的化合物加入至盤。准許該丙酮蒸發5分鐘。以包含殺黴菌劑的蓋子覆蓋該廣口瓶，及以揮發性殺黴菌劑培養1、3、6、24或72小時。在培養後，以沒有化合物A的新蓋子置換包含該盤與化合物A的蓋子。全部樣品維持在21°C下3天，然後移除蓋子及維持額外48小時，全部皆在90%R.H.下。評估果實的疾病發生率及嚴重性與植物毒性之顯露。結果總整理在表5中。化合物A在6小時曝露後於0.125毫克/盤下100%控制灰色葡萄孢菌，及無植物毒性證據。0.125毫克化合物A顯示出100%活體內抑制，與僅有丙酮的對照比較。代表性結果亦顯示在圖5中。

表5. 在草莓上的灰色葡萄孢菌

化合物A 比例 (毫克/盤)	發生率(%)		嚴重性(0至3)	
	0.008	0.125	0.008	0.125
時間(小時)1	100 %	67 %	4.0	2.3
3	0 %	33 %	0.0	1.3
6	33 %	0 %	1.0	0.0
24	67 %	0 %	2.3	0.0
72	33 %	0 %	1.0	0.0

嚴重性：

0=無真菌生長

1=輕微感染(直徑<5毫米)

2=中度感染(直徑<1公分)

3=高度感染(直徑>1公分)

4=極度感染(>果實的半長度)

實施例7

[0189]使用12井(每井7毫升體積)微滴板用於揮發性抗微生物化合物的試管內抑制試驗。對每井加入3毫升體積的全強度LB瓊脂。在冷卻後，將15微升的大腸桿菌調整至光學密度0.02至0.035及進一步稀釋1/10，將其吸移至瓊脂中心及傾斜以均勻地分佈。將小的Whatman #1過濾盤(目錄編號1001-0155)放在聚乙烯PCR板密封膜的底面上，一式二份。爲了測量最小抑制濃度(MIC)，化合物A(苯并氧雜硼；圖1)係在丙酮中稀釋及將5毫克化合物加入至盤。准許該丙酮蒸發5分鐘。然後，藉由該膜將繞著大腸桿菌接種體的頂端空間與包含該殺菌劑的黏附盤密封在該井內。倒置該板，

將其放在經處理的盤上及密封以防止任何化學藥品從盤剝脫及落到該經接種的瓊脂上。在4°C下儲存3天後，將該培養物轉移至23°C額外2天，然後相對於對照評估菌落生長。實驗結果總整理在表6中。結果建議化合物A能夠抑制大腸桿菌。

表6. 揮發性殺黴菌劑的試管內試驗之結果	
化合物A的比例(每盤的毫克數)	菌落等級評定
5.00	1
未處理	3
未接種	0

菌落等級評定：

0=無菌落

1=微菌落，不連接

2=小的菌落，有某些融合

3=大菌落融合在一起

實施例8

[0190]使用12井(每井6.5毫升體積)微滴板用於揮發性抗微生物化合物的試管內抑制試驗。對每井加入3毫升體積的全強度馬鈴薯右旋糖瓊脂(PDA)。在冷卻後，將1微升的每毫升 1×10^5 灰色葡萄孢菌、擴展青黴菌(*Penicillium expansum*)、互生鏈格孢菌(*Alternaria alternata*)、果生鏈核盤菌(*Monilinia fructicola*)或圍小叢殼(*Glomerella cingulata*)孢子懸浮液點吸移至瓊脂中心。在揮發性殺黴菌劑處理前，立即接種該板。將Whatman #1過濾盤(目錄編號1001-0155)

放在聚乙烯PCR板密封膜的底面上，一式二份。爲了測量最小抑制濃度(MIC)，在丙酮中稀釋化合物，及以劑量相依的方式將適當量的化合物加入至盤以達成1142.9至0.6毫克/升的最後頂端空間濃度。准許該丙酮蒸發5分鐘。然後，藉由該膜將繞著接種體的頂端空間與包含該殺黴菌劑的黏附盤密封在該井內，藉由將該板倒置在該經處理的盤上及密封以防止任何化學藥品從盤剝脫及落到該經接種的瓊脂上。在23℃下儲存3天後，根據真菌菌落直徑之測量，相對於對照評估該培養物的生長百分比。實驗結果總整理在表7中。結果指示出苯并氧雜硼化合物對抗五種經選擇的植物真菌病原體具有優良的試管內活性。

表7. 數種苯并氧雜硼化合物施加作為揮發性處理對抗數種植物真菌病原體(化合物10係與化合物A相同，及化合物11係與化合物B相同)之MIC(毫克/升，頂端空間濃度)。

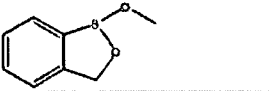
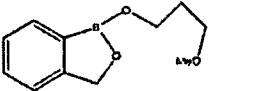
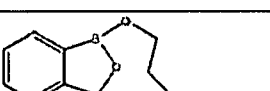
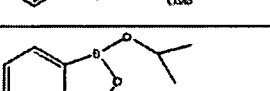
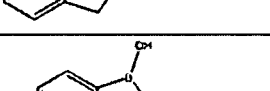
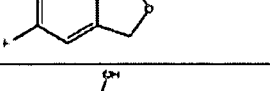
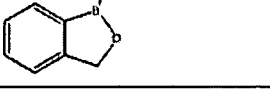
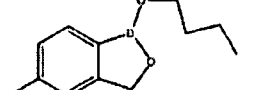
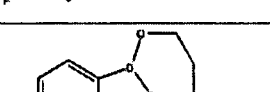
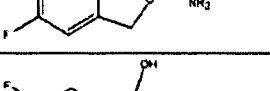
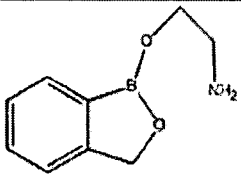
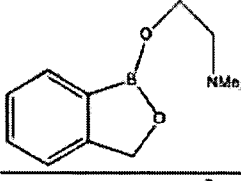
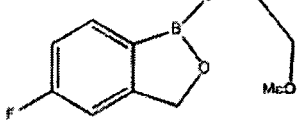
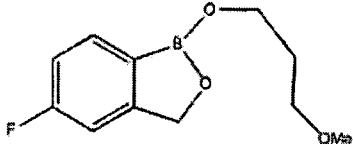
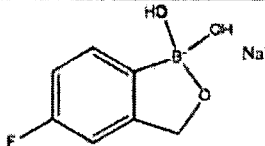
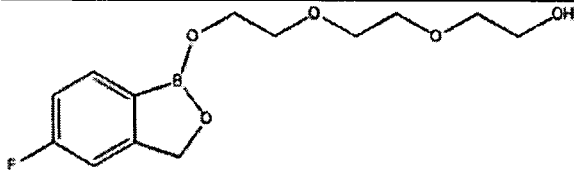
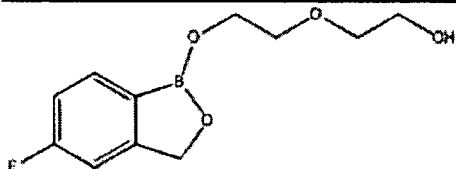
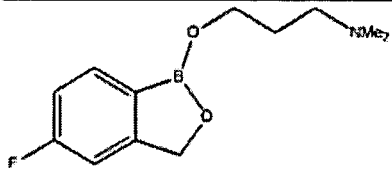
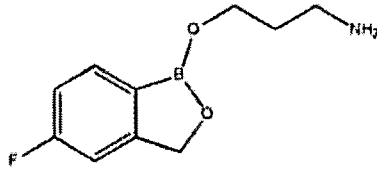
結構	化合物 編號	灰色葡萄 孢菌	擴展 青黴菌	MIC 互生鏈 格孢菌	果生鏈 核盤菌	圃小 叢霉
	6	2.2	17.9	4.5	8.9	17.9
	7	2.2	17.9	8.9	8.9	71.4
	8	2.2	35.7	8.9	4.5	71.4
	9	2.2	8.9	8.9	8.9	35.7
	10	2.2	2.2	<0.6	<0.6	<0.6
	11	4.5	17.9	4.5	2.2	35.7
	30	2.2	8.9	2.2	2.2	n/a
	34	<0.6	2.2	2.2	n/a	n/a
	200	10.6	68.3	7.3	6.3	n/a
	201	3.8	29.5	16.1	8.5	9.3

表8. 數種苯并氧雜硼化合物施加作為揮發性處理對抗灰色葡萄孢菌及擴展青黴菌植物真菌病原體的MIC(毫克/升)。

結構	化合物 編號	MIC	
		灰色葡萄 孢菌	擴展 青黴菌
	21	1.1	35.7
	22	4.5	35.7
	38	0.6	8.9
	39	0.6	8.9
	54	0.6	4.5
	55	4.5	>35.7
	62	2.2	8.9
	63	1.1	17.9
	64	1.1	8.9

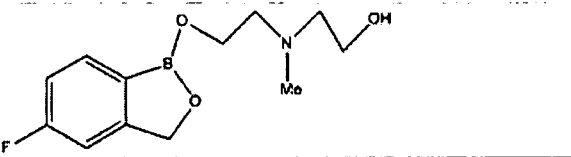
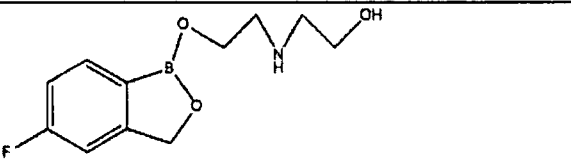
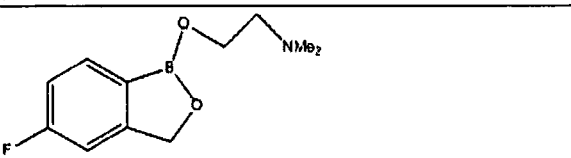
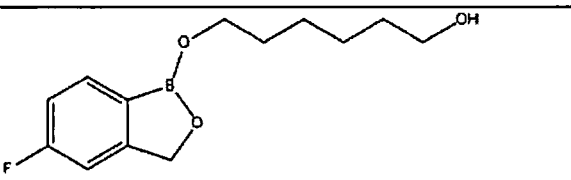
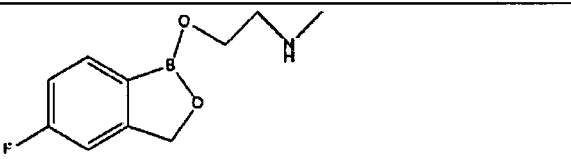
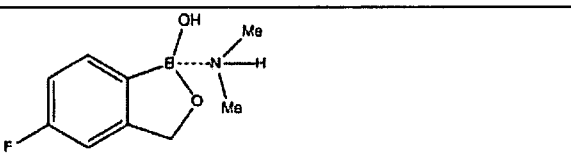
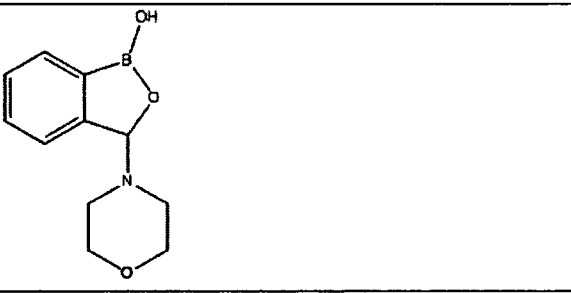
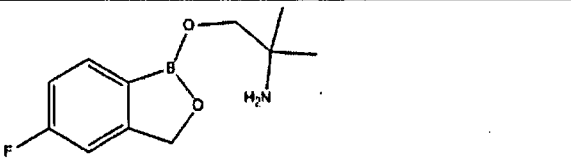
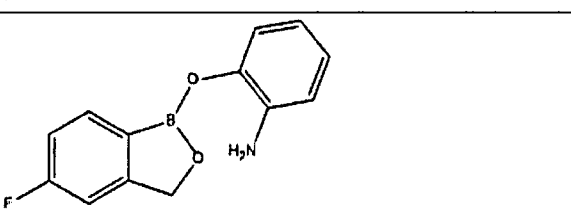
	72	35.7	>35.7
	73	35.7	>35.7
	74	2.2	35.7
	86	0.6	8.9
	87	0.6	8.9
	105	0.6	4.5
	114	17.9	>35.7
	115	0.6	8.9
	116	1.1	8.9

表8-接續

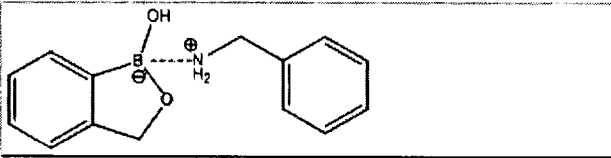

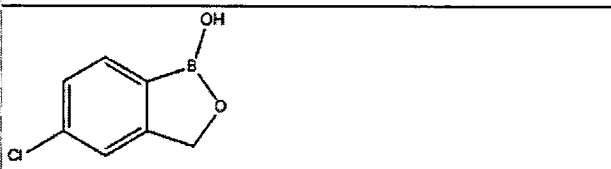
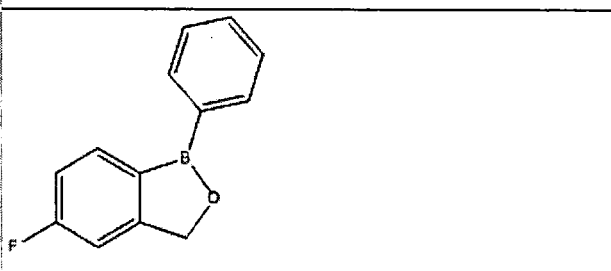
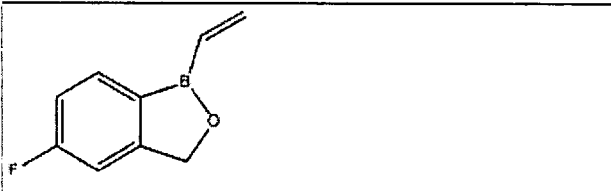
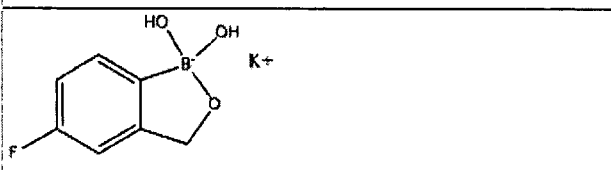
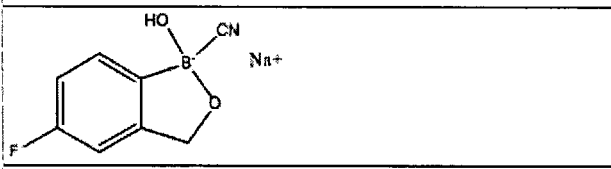
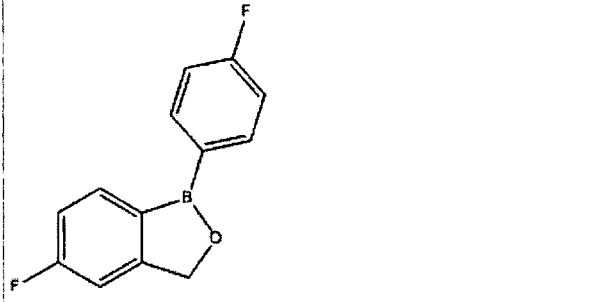
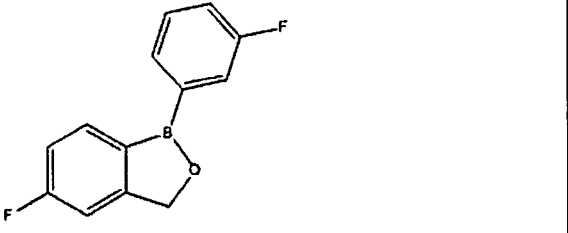
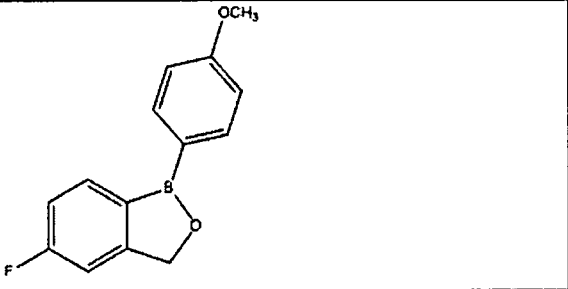
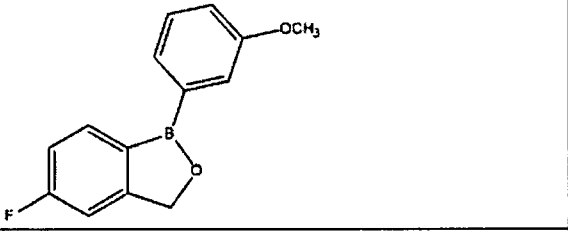
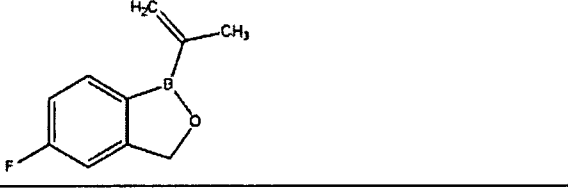



	121	4.5	17.9
	122	2.2	17.9
	124	4.5	8.9
	127	2.2	4.5
	129	4.5	8.9
	130	1.1	4.5
	132	1.1	4.5
	133	8.9	35.7

表8-接續

	134	17.9	>35.7
	135	17.9	>35.7
	136	8.9	>35.7
	137	0.3	1.1
	202	35.7	142.9
	203	8.9	142.9
	204	8.9	>35.7

實施例9

[0191] 使用12井(每井6.5毫升體積)微滴板用於揮發性抗微生物化合物的試管內抑制試驗。對每井加入3毫升體積的

全強度馬鈴薯右旋糖瓊脂(PDA)。在冷卻後，將1微升的每毫升 1×10^5 灰色葡萄孢菌及擴展青黴菌孢子懸浮液點吸移至瓊脂中心。在揮發性殺黴菌劑處理前，立即接種該板。將Whatman #1過濾盤(目錄編號1001-0155)放在聚乙烯PCR板密封膜的底面上，一式二份。爲了測量最小抑制濃度(MIC)，在丙酮中稀釋化合物，及以劑量相依的方式將適當量的化合物加入至盤以達成35.7至0.03毫克/升的最後頂端空間濃度。准許該丙酮蒸發5分鐘。然後，藉由該膜將繞著該接種體的頂端空間與包含該殺黴菌劑的黏附盤密封在該井內，藉由將該板倒置在該經處理的盤上及密封以防止任何化學藥品從盤剝脫及落到該經接種的瓊脂上。在23°C下儲存3天後，根據真菌菌落直徑之測量，相對於對照評估該培養物的生長百分比。實驗結果總整理在表8中。結果指示出數種苯并氧雜硼化合物對抗二種經選擇的植物真菌病原體具有優良的試管內活性。

實施例10

[0192]使用12井(每井6.5毫升體積)微滴板用於揮發性抗微生物化合物A及B(圖1)對抗數種植物真菌病原體的試管內抑制試驗。對每井加入3毫升體積的全強度馬鈴薯右旋糖瓊脂(PDA)。在冷卻後，將1微升的每毫升 1×10^5 孢子灰色葡萄孢菌、擴展青黴菌、互生鏈格孢菌、圍小叢殼、指狀青黴菌(*Penicillium digitatum*)、果生鏈核盤菌(*Monilinia fruticola*)、巴西麴菌(*Aspergillus brasiliensis*)、急尖炭疽刺盤孢菌(*Colletotrichum acutatum*)、接骨木鏟孢菌(*Fusarium sambucinum*)、辣椒疫病菌(*Phytophthora capsici*)、念珠狀地絲菌(*Geotrichum candidum*)、黑麴菌(*Aspergillus niger*)、棉色二孢菌(*Diplodia gossypina*)或柑橘間座殼菌(*Diaporthe citrii*)

懸浮液點至瓊脂中心。將Whatman #1過濾盤(目錄編號1001-0155)放在聚乙烯PCR板密封膜的底面上，一式二份。爲了測量最小抑制濃度(MIC)，在丙酮中稀釋測試化合物，及以劑量相依的方式將適當量的化合物加入至盤以達成35.7至0.03毫克/升的最後頂端空間濃度。准許該丙酮蒸發五分鐘。然後，藉由該膜將繞著該接種體的頂端空間與包含該殺黴菌劑的黏附盤密封在該井內，藉由將該板倒置在該經處理的盤上及密封以防止任何化學藥品從盤剝脫及落到該經接種的瓊脂上。在23°C下儲存3天後，相對於對照評估該培養物的生長百分比。顯示在表9中的結果闡明苯并氧雜硼化合物A及B經由揮發性活性控制數種真菌植物病原體生長的能力。

表9. 化合物A及B施加如爲揮發物對抗數種真菌植物病原體的MIC (毫克/升)

病原體	化合物A	化合物B
	MIC	MIC
灰色葡萄孢菌	2.2	4.5
擴展青黴菌	1.1	8.9
果生鏈核盤菌	2.2	1.1
互生鏈格孢菌	2.2	2.2
圍小叢殼	17.9	35.7
指狀青黴菌	2.2	4.5
巴西麴菌	2.2	0.6
急尖炭疽刺盤孢菌	4.4	8.9
接骨木鐮孢菌	1.1	4.5
辣椒疫病菌	1.1	n/a
念珠狀地絲菌	8.9	8.9
黑麴菌	2.2	1.1
梨狀毛黴菌(<i>M. piriformis</i>)	1.1	2.2
棉色二孢菌	1.1	4.5
柑橘間座殼菌	2.2	17.9

實施例11

[0193]使用12井(每井6.5毫升體積)微滴板用於揮發性抗微生物化合物A(圖1)對抗數種細菌病原體的試管內抑制試驗。對每井加入3毫升體積的營養瓊脂及允許在引進病原體前乾燥。將大腸桿菌、胡蘿蔔果膠桿菌(*Pectobacterium carotovorum*)、地毯草黃單孢桿菌(*Xanthomonas axonopodis*)及腸道沙門氏菌(*Salmonella enterica*)細胞懸浮液調整至光學密度0.2至0.35，及進一步稀釋1/10，及將15微升吸移至每井的中心，且傾斜以均勻地分佈。將Whatman #1濾紙(CAT 1001-0155)放在聚乙烯PCR板密封膜的底面上。爲了測量最小殺菌濃度(MBC)，在丙酮中稀釋化合物A及以劑量相依的方式將50微升施加至盤，一式二份，以達成71.4至0.03毫克/升的最後頂端空間濃度。准許該丙酮蒸發5分鐘。然後，將該膜與經處理的盤施加在該經接種的板上及密封。倒置該板，及在23 °C下培養48小時。在培養時期後，在包含Tween 80(0.001%)的無菌水中逐出細菌菌落及測量OD(600奈米)。結果總整理在表10中，其中報導出控制至少80%的細菌生長所需要之頂端空間濃度。化合物A顯示出在此試管內試驗中對抗許多細菌有好的抗微生物活性。

表10. 化合物A對抗細菌病原體提供至少80%控制之的比例(毫克/升)

大腸桿菌	胡蘿蔔果膠桿菌	地毯草黃單孢桿菌	腸道沙門氏菌
35.7	2.2	4.5	17.9

實施例12

[0194]爲了評估揮發性抗微生物化合物10的活體內活

性，在新鮮牛肉上展開揮發性生物鑑定以評估對大腸桿菌及腸道沙門氏菌的控制。藉由在溫水中洗滌2分鐘清洗牛肉以移除任何天然接種體。將二條長條、單層放在無菌10.8杯SnapWare氣密容器(型號#109842)中。

表11. 在以化合物A揮發性處理後，來自牛肉的大腸桿菌及腸道沙門氏菌之菌落形成單位(CFU/毫升)及對數減少。

病原體	處理	對數CFU/毫升	對數減少
大腸桿菌	對照	8.27	3.17
	化合物A	5.09	
腸道沙門氏菌	對照	7.38	2.43
	化合物A	4.95	

[0195] 每條長條係藉由將20微升的大腸桿菌或腸道沙門氏菌細胞懸浮液放置在表面上接種，其中該懸浮液係調整至光學密度0.35(600奈米)及進一步稀釋1/10。爲了測量效力，將化合物A粉末以所需要的比例引進具有昇華裝置(銅管以0.5升/分鐘的風扇流加熱至200°C)的容器中，以達成100毫克/升的最後頂端空間濃度。然後，在21°C下培養該容器2天。在處理後，清洗牛肉，收集清洗物，連續地稀釋，在營養瓊脂上平板接種，然後在37°C下培養額外24小時。計數細菌菌落及以菌落形成單位(CFU/毫升)表示，且相對於對照計算對數減少。列在表11中的結果顯示出在此使用牛肉的活體內試驗中，化合物A對抗大腸桿菌及腸道沙門氏菌有好的抗微生物活性。化合物A闡明大腸桿菌係3.17對數減少(>99.9%)及腸道沙門氏菌係2對數減少。

實施例13

[0196] 爲了評估揮發性抗微生物化合物A在控制觀賞

植物花卉的灰色葡萄孢菌上之活體內活性，使用白色康乃馨展開揮發性生物鑑定。將五朵康乃馨放在包含200毫升常見的商業花卉防腐劑之800毫升廣口瓶中。然後，將五個廣口瓶放在117升Rubbermaid儲存盒(CAT#2244)中。該花瓣以5毫升的 1×10^5 孢子/毫升灰色葡萄孢菌懸浮液均勻地噴灑接種。將該桶緊緊地封閉。對處理施加來說，將化合物A溶解在水性1,2-丙二醇溶液(3:1)中，及使用ES-100-H SmartFog系統(Reno, NV)，經由 $\frac{1}{2}$ "側向孔口將5毫升溶液揮發進容器中，其中該孔口在施加後立即密封。在21°C下培養該花卉3天。在儲存後，於21°C下根據在花瓣上相對於未經處理的對照花卉之疾病顯現來評估花卉的發生率最高8天，結果總整理在表12中。在此觀賞植物花卉的感染之活體內分析中，1毫克/升的化合物A於處理移除後2天顯示出0%發生率，及在8天後僅有16%發生率，及此通常闡明對抗灰色葡萄孢菌有好的揮發性抗微生物活性。

表12. 在以化合物A處理的康乃馨上之灰色葡萄孢菌發生率

化合物A 比例(毫克/升)	在花瓣上的疾病發生率(%)				
	第0天	第1天	第2天	第3天	第8天
1	0	0	0	4	16
0.2	0	8	20	16	36
0.04	0	0	16	40	92
對照	0	68	92	96	100

實施例14

[0197] 同樣地，在白色康乃馨(以或未以商業抗乙烯化合物硫代硫酸銀；STS處理)上以天然接種體進行與上述類似的測試。將化合物A溶解在水性1,2-丙二醇溶液(3:1)中，

及使用ES-100-H SmartFog系統(Reno, NV), 經由½”側向孔口揮發5毫升溶液, 其中該孔口在施加後立即密封; 或將其溶解在丙酮中及施加至42.5毫米Whatman #1過濾盤(目錄編號1001-042), 且在允許該丙酮蒸發5分鐘後放在錶玻璃上。該花卉在21°C下培養3天。在儲存後, 根據顯現在花瓣及萼片上的病灶數目來評估花卉之疾病嚴重性額外8天。在此活體內分析中, 列在表13中的結果顯示出對抗灰黴菌屬有好的抗微生物活性。

表13. 在以化合物10主動氣霧或被動揮發性處理後, 在8天閑置壽命後, 根據在花瓣及萼片上的病灶數目之灰色葡萄孢菌嚴重性。

植物部分	化合物A 比例(毫克/升)	嚴重性(病灶數目)			
		無STS		STS	
		氣霧	揮發性	氣霧	揮發性
花瓣	1	0	1.5	0	0.1
	0.2	0	1.8	0	0.1
	0.04	0.4	3.1	0.3	0.5
	0	2.1	18.8	7.7	43.2
萼片	1	0.04	1	0.04	0.2
	0.2	0.04	1.6	0.1	0.3
	0.04	0.3	2.1	0.6	1.1
	0	4.5	4.8	6.8	3.6

實施例15

[0198]同樣地, 以天然接種體在白色玫瑰花上進行與上述類似的測試。將五朵白色玫瑰花放在包含200毫升常見的商業花卉防腐劑之800毫升廣口瓶中。然後, 將三個廣口瓶放在117升Rubbermaid儲存盒(CAT#2244)中。將二個小風扇放在該容器的相對端中以幫助化合物10的揮發性分佈。緊

緊地封閉該桶，然後將化合物A在丙酮中稀釋，然後吸移至1.5英吋x1英吋棉花長條。允許該丙酮蒸發五分鐘。然後，藉由昇華裝置(銅管以0.5升/分鐘的風扇流加熱至200°C)，經由½”側向孔口將化合物A引進至該容器以達成0.04、0.2、1毫克/升的最後頂端空間濃度，其中該孔口在施加後立即密封。再者，將化合物A吸移在由錶玻璃支撐的42.5毫米Whatman #1過濾盤(目錄編號1001-042)上，其中在密封該容器前允許該丙酮蒸發五分鐘。該花卉在21°C下培養三天。在處理後，評估花卉之花瓣的疾病發生率及嚴重性額外二天。經由昇華施加1毫克/升的處理產生0%發生率。玫瑰花瓣在以化合物A處理後無疾病發生率，保持白色顏色及無花瓣掉落。列在表14中的結果顯示出對抗白色玫瑰的灰色葡萄孢菌感染有好的抗微生物活性，及經由昇華提高揮發比例產生較大的疾病控制。

表14. 在21°C下之化合物A揮發性處理三天及在21°C下額外二天後，根據在白色玫瑰的花瓣及萼片上之感染的灰色葡萄孢菌發生率及嚴重性。

化合物10	經由昇華施加		從Whatman過濾器揮發	
比例(毫克/升)	發生率(%)	嚴重性(0-4)*	發生率(%)	嚴重性(0-4)*
1	0	0	53.3	1.6
0.2	13.3	0.5	66.7	1.8
0.04	46.7	1.7	46.7	1.1
對照-丙酮	80	2.9	86.7	2.4
對照	100	3.1	100	3.1

*嚴重性等級評定

0 =無疾病

1=在萼片或花瓣上變褐色及有小病灶

2=變褐色，花瓣覆蓋真菌孢子

3=變褐色，花瓣覆蓋真菌孢子，某些花瓣掉落

4=變褐色，花瓣覆蓋真菌孢子，某些花卉發育不全

實施例16

[0199] 爲了測試化合物10(圖1)在蔬菜上的效應，從本地庫存獲得馬鈴薯、洋蔥及笋瓜，並以0.825%的NaOCl消毒表面。將馬鈴薯薄切片或二片洋蔥葉子放在無菌培養皿中，同時將整顆笋瓜放在無菌10.8杯SnapWare氣密容器(型號#109842)中。每片馬鈴薯薄切片以20微升的 1×10^5 孢子/毫升接骨木鏟孢菌接種，同時洋蔥以20微升的 1×10^6 孢子/毫升灰色葡萄孢菌接種。對笋瓜之接種來說，移出小果心及塞入辣椒疫病菌的菌絲栓且以該果心覆蓋。化合物10在丙酮中稀釋，及以一比例將其加入至接附至蓋子的內邊之42.5毫米Whatman #1過濾盤(目錄編號1001-042)，以達成10毫克/升的最後頂端空間濃度。在石蠟膜密封該板或封閉該氣密容器前，准許該丙酮蒸發5分鐘。讓該蔬菜在21°C下培養3天，及評估菌絲生長、乾腐病及水浸泡的外觀(毫米直徑)，結果總整理在表13中。化合物10闡明在此使用3種不同蔬菜農作物的活體內試驗中對3種植物病原體有好的真菌控制。

表15. 化合物A在馬鈴薯、洋蔥及笋瓜上控制真菌生長的效應。

處理	馬鈴薯		洋蔥	笋瓜	
	接骨木鏟孢菌		灰色葡萄孢菌	辣椒疫病菌	
	菌絲生長	乾腐病	水浸泡	水浸泡	菌絲生長
10毫克/升	0	0	0	5.3	1.1
對照-丙酮	4.3	4.7	7	24	17.4
對照-無丙酮	31.6	10.3	8.5	30.9	24.7

實施例17

[0200] 爲了測試化合物A在蔬菜的細菌病原體控制上之效應，將馬鈴薯、洋蔥及胡蘿蔔細切成小立方體及以0.825%的NaOCl消毒表面，及允許乾燥。將每種蔬菜的四個小立方體(大約1平方公分)放置在無菌培養皿中。每個立方體以25微升胡蘿蔔果膠桿菌(細菌濃度OD 1.0，600奈米)接種。爲了測量效力，在丙酮中稀釋化合物A，及將達成50毫克/升的最後頂端空間濃度之適當體積加入至接附至蓋子內邊的42.5毫米Whatman #1過濾盤(目錄編號1001-042)。在封閉該板及以石蠟膜密封其之前，准許該丙酮蒸發五分鐘。在10°C下培養該蔬菜四天。列在表16中的結果闡明在此活體內分析中，在洋蔥(2.14對數減少)、胡蘿蔔(0.29對數減少)及馬鈴薯(0.84對數減少)上對抗胡蘿蔔果膠桿菌的抗微生物活性。

表16. 化合物A(50毫克/升)在減少胡蘿蔔果膠桿菌於馬鈴薯、洋蔥及胡蘿蔔上生長之效應。

農作物	處理	對數CFU/毫升	對數減少
馬鈴薯	對照	7.47	
	化合物10	6.63	0.84
洋蔥	對照	8.13	
	化合物10	5.99	2.14
胡蘿蔔	對照	6.36	
	化合物10	6.06	0.29

實施例18

[0201] 爲了評估揮發性抗微生物化合物A在果實中的活體內活性，使用草莓、葡萄及藍莓展開揮發性生物鑑定。

將八顆草莓、16顆葡萄或30顆藍莓(每次重覆(per rep)時)放在商業相關按尺寸製作的PET蚌殼包裝中,其中藍莓及葡萄的梗末端面向上及草莓向下。新鮮的傷口以20微升(草莓及葡萄)或10微升(藍莓)的每毫升 1×10^6 灰色葡萄孢菌孢子懸浮液接種。將該蚌殼包裝放在10.8杯SnapWare氣密容器(型號#109842)內。將42.5毫米Whatman #1過濾盤(目錄編號1001-042)放在錶玻璃上。將化合物A溶解在丙酮中及以劑量相依的方式加入至盤以產生0.4、2或10毫克/升的最後頂端空間濃度。准許該丙酮蒸發五分鐘。然後,以蓋子封閉該容器及放置在21°C下三天。在儲存後,評估果實在21°C下額外三天的疾病發生率及嚴重性(0至4),結果總整理在表17中。結果闡明草莓、葡萄及藍莓在三天閑置壽命後對灰色葡萄孢菌有好的活體內揮發性抗微生物控制,其中發生率降低大約50%及嚴重性戲劇性降低。

表17. 化合物A(0.4、2或10毫克/升)的三天揮發性處理,在處理後3天評估時期期間,於21°C下,在控制草莓、葡萄及藍莓的灰色葡萄孢菌感染之發生率及嚴重性上的效應。

化合物A 比例(毫克/升)	評估 天	草莓		葡萄		藍莓	
		發生率 (%)	嚴重性 (0-4)	發生率 (%)	嚴重性 (0-4)	發生率 (%)	嚴重性 (0-4)
10	0	7.1	0	0	0	12.9	0.1
2	0	14.3	0.1	0	0	9.7	0
0.4	0	0	0	3.1	0	21	0.1
對照	0	50	0.4	100	2.3	95.2	1.2
10	1	35.7	0.2	0	0	12.9	0.1
2	1	50	0.3	0	0	9.7	0
0.4	1	21.4	0.1	3.1	0	21	0.2
對照	1	100	1	100	2.5	100	1.7

10	2	42.9	0.5	3.1	0	12.9	0.2
2	2	50	0.3	0	0	9.7	0.1
0.4	2	21.4	0.1	15.6	0.2	40.3	0.5
對照	2	100	2.2	100	2.7	100	1.9
10	3	42.9	0.8	56.3	0.4	41.9	0.6
2	3	64.3	0.5	56.3	0.3	40.3	0.6
0.4	3	28.6	0.5	62.5	0.5	62.9	1
對照	3	100	2.7	100	3.8	100	2.1

*嚴重性

0 =無真菌生長

1 =輕微感染(在傷口內僅可以顯微鏡看見)

2 =中度感染(在接種位置處可看見的生長)

3 =高度感染(直徑>1公分的圓錐形體之灰黴菌屬)

4 =極度感染(>果實的半長度)

實施例19

[0202]爲了評估揮發性抗微生物化合物A在果實中的活體內活性，使用柑橘果實展開揮發性生物鑑定。將二顆柑橘放在PET蚌殼包裝內。每顆柑橘的三個新鮮傷口以30微升的每毫升 1×10^6 指狀青黴菌孢子懸浮液接種。將該蚌殼包裝放在10.8杯SnapWare氣密容器(型號#109842)內。將42.5毫米Whatman #1過濾盤(目錄編號1001-042)放在錶玻璃上。將化合物A溶解在丙酮中及以劑量相依的方式加入至盤以產生2、10或50毫克/升的最後頂端空間濃度。准許該丙酮蒸發五分鐘。然後，以蓋子封閉該容器及放置在21°C下三天。在儲存後，於21°C下評估果實在果實表面上之疾病發生率(腐壞的直徑毫米)及病原體芽孢產生(毫米直徑)額外二天，結果總整理在表18中。結果闡明在經接種的柑橘中對指狀青黴菌有好的活體內揮發性抗微生物控制，特別在比例大於10毫克/升下。

表18. 指狀青黴菌在柑橘類上的發生率及嚴重性，如由在果實表面上的水浸泡病灶及真菌孢子描出

化合物A 比例(毫克/升)	水浸泡病灶(毫米)			芽孢產生(毫米)		
	第0天	第1天	第2天	第0天	第1天	第2天
50	0	0	5	0	0	1.2
10	0	0	9	0.5	0.4	2.5
2	0	0	13.4	0	0.4	2.7
對照	17.8	31.2	52.4	5	15.1	35.6

實施例20

[0203] 爲了評估揮發性抗微生物化合物A在果實中的活體內活性，使用蘋果展開揮發性生物鑑定。將二顆蘋果放在PET蚌殼包裝內。每顆蘋果的三個新鮮傷口以30微升的每毫升 1×10^6 擴展青黴菌孢子懸浮液接種。將該蚌殼包裝放在10.8杯SnapWare氣密容器(型號#109842)內。將42.5毫米Whatman #1過濾盤(目錄編號1001-042)放在錶玻璃上。將化合物A溶解在丙酮中及以一方式加入至盤以產生50毫克/升的最後頂端空間濃度。准許該丙酮蒸發五分鐘。然後，以蓋子封閉該容器及放置在 21°C 下三天。在儲存後，於 21°C 下評估果實在果實表面上的疾病發生率(腐壞直徑的毫米)及病原體芽孢產生(毫米直徑)額外三天，結果總整理在表19中。結果闡明蘋果在處理後最高3天對擴展青黴菌有100%活體內揮發性抗微生物控制。

表19. 擴展青黴菌在蘋果上的發生率及嚴重性，如由在果實表面上的褐腐病及真菌孢子描出

化合物A 比例(毫克/升)	腐壞(毫米)				芽孢產生(毫米)			
	第0天	第1天	第2天	第3天	第0天	第1天	第2天	第3天
50	0	0	0	0	0	0	0	0
對照	15.9	20.1	25.7	30	3.5	3.9	3.9	6.5

實施例21

[0204]爲了評估揮發性抗微生物化合物B在果實中的活體內活性，使用柑橘展開揮發性生物鑑定。每次重覆時，將二顆柑橘放在蚌殼包裝內。每顆柑橘的三個新鮮傷口以30微升的每毫升 1×10^6 指狀青黴菌孢子懸浮液接種。將該蚌殼包裝放在10.8杯SnapWare氣密容器(型號#109842)內。藉由昇華裝置(銅管以0.5升/分鐘的風扇流加熱至 200°C)將化合物B粉末引進至容器，以達成0.4、2、10或50毫克/升的最後頂端空間濃度。然後，以蓋子封閉該容器及放置在 21°C 下三天。在儲存後，於 21°C 下評估果實在果實表面上的疾病發生率(腐壞直徑的毫米)及病原體芽孢產生(毫米直徑)額外三天，結果總整理在表20中。結果闡明在柑橘中在比例0.4毫克/升下對指狀青黴菌有好的活體內揮發性抑制，及在10毫克/升下完全抑制。

表20. 指狀青黴菌在柑橘上之發生率及嚴重性，如由在以化合物B處理後於果實表面上之水浸泡病灶及真菌孢子描出。

化合物B 比例(毫克/升)	水浸泡病灶(毫米)				芽孢產生(毫米)			
	第0天	第1天	第2天	第3天	第0天	第1天	第2天	第3天
50	0	0	0	0	0	0	0	0
10	0	0	0	0.8	0	0	0	0
2	0.5	7.8	30.7	42.6	0	0.3	2.8	5.7
0.4	5.7	29.4	49.3	63.4	0.7	1.4	8.1	27.2
對照	12.3	35.5	61.1	83.2	0.3	2.7	8.5	44.5

實施例22

[0205]爲了評估揮發性抗微生物化合物A(圖1)在果實中的活體內活性，使用蘋果、梨子、柑橘，草莓、葡萄及藍莓展開揮發性生物鑑定。二顆蘋果、2顆柑橘、2顆梨子、

8顆草莓、16顆葡萄或30顆藍莓(每次重覆時，一式二份)放置在蚌殼包裝中，其中全部果實的梗末端面向上，除了草莓(梗末端面向下)外。新鮮的傷口以20微升的每毫升 1×10^6 擴展青黴菌孢子懸浮液(蘋果及梨子)、20微升的每毫升 1×10^6 指狀青黴菌孢子懸浮液(柑橘)、及20微升(草莓及葡萄)或10微升(藍莓)的每毫升 1×10^6 灰色葡萄孢菌孢子懸浮液接種。將該蚌殼包裝放在117升Rubbermaid儲存盒(CAT#2244)內及封閉蓋子。將溶解在丙酮中的化合物A吸移到棉花長條上，其中允許該丙酮蒸發五分鐘，然後藉由昇華裝置(銅管以0.5升/分鐘的風扇流加熱至 200°C)引進該容器，以達成10毫克/升的最後頂端空間濃度。然後，將該容器保持在 21°C 下三天。在處理後，將果實保持在 21°C 下額外三天，然後對蘋果、梨子及柑橘評估疾病發生率(變褐色或水浸泡病灶的毫米直徑)及病原體芽孢產生(毫米直徑)，和草莓、葡萄及藍莓之灰色葡萄孢菌疾病發生率(%)及嚴重性(0至4)，結果總整理在表21中。結果闡明當以揮發性殺黴菌劑施加時，在至少六種不同宿主上對至少三種真菌病原體有好的活體內抗微生物控制。

表21. 昇華化合物A的效應，如由灰色葡萄孢菌在草莓、葡萄及藍莓上的發生率及嚴重性、及在柑橘、蘋果及梨子上的嚴重性反映，如由水浸泡病灶、變褐色及芽孢產生在三天處理加上於 21°C 下額外三天後描出。

處理 (10毫克/升)	發生率(%)			嚴重性(0-4)		
	草莓	藍莓	葡萄	草莓	藍莓	葡萄
化合物A	18.8	5	26.7	0.09	0.03	0.1
對照	100	100	80	3.6	2.2	0.9

	水浸泡病灶 變褐色(毫米)		芽孢產生(毫米)		
	柑橘	蘋果 梨子	蘋果	柑橘	梨子
化合物A	3.04	5.4 2.7	0	8.55	0
對照	50.5	11.5 23.3	4.8	33.2	15.5

實施例23

[0206]爲了比較化合物A當藉由不同機制主動地揮發時的能力，使用草莓進行活體內試驗。將八顆草莓放置在蚌殼包裝中以梗末端面向下。新鮮的傷口以20微升的每毫升 1×10^5 灰色葡萄孢菌孢子懸浮液接種。將蚌殼包裝放置在10.8杯SnapWare氣密容器(型號#109842)中及以蓋子封閉。將化合物A溶解在丙酮中及藉由ES-100-H SmartFog系統(Reno, NV)，經由可密封的 $\frac{1}{2}$ 英寸側向孔口揮發。再者，將溶解在丙酮中的化合物A吸移到棉花長條上，其中允許該丙酮蒸發五分鐘，然後藉由昇華裝置(銅管以0.5升/分鐘的風扇流加熱至 200°C)引進該容器中，以達成10毫克/升的最後頂端空間濃度。將果實貯存在 21°C 下三天。在三天處理後，於 21°C 下貯存果實額外三天，然後評估疾病的發生率(%)及嚴重性(0至4)。結果總整理在表22中，及闡明在此活體內分析中對抗灰色葡萄孢菌有好的抗微生物活性，此指示出化合物A係一種有效的揮發性抗微生物。

表22. 化合物A之不同揮發性施加方法的效應，如由在三天處理加上在 21°C 下額外三天後，灰色黴菌於草莓上的發生率及嚴重性反映。

處理	發生率(%)	嚴重性(0至4)
氣霧，10毫克/升化合物10	6.3	0.03
氣霧，對照	62.5	1.6
昇華，10毫克/升化合物10	0.0	0.0
昇華，對照	100.0	3.7

實施例24

[0207]使用活體內試驗來評估化合物A從不同材料揮發及控制真菌病原體的能力。將八顆草莓放置在蚌殼包裝中以梗末端面向下。新鮮的傷口以20微升的每毫升 1×10^6 灰色葡萄孢菌孢子懸浮液接種。然後，將該蚌殼包裝放置在10.8杯SnapWare氣密容器(型號#109842)中。將化合物A溶解在丙酮中，然後以200毫克/平方公尺之比例均勻地噴灑到纖維素紙及Tyvek®織物上。允許該丙酮蒸發。同樣地，將化合物A溶解在丙二醇中及均勻地噴灑到纖維素紙及Tyvek®織物上。於此情況中，不試圖蒸發。

表23. 在三天處理及儲存於21°C下額外二天後，不同膜及隨後釋放化合物A在草莓上之灰色葡萄孢菌的發生率及嚴重性之效應。

比例(毫克/升)	膜型式	發生率(%)	嚴重性(0-4)
0.4	纖維素紙	37.5	0.8
2	纖維素紙	37.5	0.7
10	纖維素紙	12.5	0.2
0.4	TYVEK	31.3	0.5
2	TYVEK	6.3	0.1
10	TYVEK	6.3	0.3
對照	無膜	100	2.5

[0208]將材料片切割至適當尺寸以交付0.4、2或10毫克/升的最後頂端空間濃度。封閉該容器及將其放置在21°C下三天。在處理後，將果實貯存在21°C下額外二天，然後評估疾病的發生率(%)及嚴重性(0至4)，結果總整理在表23中。結果闡明化合物A對抗灰色葡萄孢菌有好的活體內抗微生物活性，其在全部比例下皆以劑量相依的方式減少發生率

及嚴重性，及該揮發性化合物可從不同材料釋放。

實施例25

[0209]使用活體內試驗來評估化合物A從不同材料揮發及控制真菌病原體的能力。將八顆草莓放置在蚌殼包裝中以梗末端面向下。新鮮的傷口以20微升的每毫升 1×10^6 灰色葡萄孢菌孢子懸浮液接種。然後，將該蚌殼包裝放置在10.8杯SnapWare氣密容器(型號#109842)中。至於用於化合物A的基材，其係放置在錶玻璃上的42.5毫米Whatman #1過濾盤(目錄編號1001-042)或典型使用來包裝草莓的10平方公分硬紙板片之任一種。將化合物A溶解在丙酮中，及以一比例將其吸移在盤上或塗裝在硬紙板上以達成0.4、2或10毫克/升的最後頂端空間濃度。准許該丙酮蒸發五分鐘。封閉該容器及放置在21°C下三天。在處理後，將果實貯存在21°C下額外二天，然後評估疾病的發生率(%)及嚴重性(0至4)，結果總整理在表24中。結果闡明化合物A對抗灰色葡萄孢菌有好的活體內抗微生物活性，其在全部比例下皆以劑量相依的方式減少發生率及嚴重性，及該揮發性化合物可從不同材料釋放。

表24. 在三天處理及儲存於21°C下額外二天後，不同膜及隨後釋放出化合物A在草莓上的灰色葡萄孢菌之發生率及嚴重性的效應。

比例(毫克/升)	材料型式	發生率(%)	嚴重性(0-4)
10	硬紙板	25	0.2
2	硬紙板	37.5	0.3
0.4	硬紙板	87.5	0.9
對照	硬紙板	93.8	2.7

10	濾紙	18.8	0.3
2	濾紙	37.5	0.6
0.4	濾紙	56.3	2.5
對照	濾紙	100	2.5

實施例26

[0210]使用試管內試驗來評估化合物A(圖1)從不同材料揮發及控制真菌生長的能力。將塗佈PTFE(8577K81)、玻璃纖維(8816K1)、二氧化矽(8799K3)、芳族聚醯胺及玻璃纖維(8821K4)、塗佈乙烯基的聚酯(8843K31)、塗佈丙烯酸的玻璃纖維(8838K2)、塗佈聚矽氧的玻璃纖維(87815K1)、PTFE(8577K81)、芳族聚醯胺(McMaster-Carr, Santa Fe Springs, CA-1206T1)、聚乙烯PCR密封膜、纖維素(Whatman #1, 目錄編號1001-0155)及硬紙板切割成直徑15毫米的盤。使用12井(每井6.5毫升體積)微滴板用於揮發性抗微生物化合物的試管內抑制試驗。對每井加入3毫升體積的全強度馬鈴薯右旋糖瓊脂(PDA)。在冷卻後,將1微升的每毫升 1×10^5 灰色葡萄孢菌孢子懸浮液點吸移至瓊脂中心。在揮發性殺黴菌劑處理前,立即接種該板。將多種材料放在聚乙烯PCR板密封膜的底面上,一式二份。為了測量最小抑制濃度(MIC),將化合物A在丙酮中稀釋,及以劑量相依的方式將適當量的化合物加入至該材料以達成35.7至0.03毫克/升的最後頂端空間濃度。准許該丙酮蒸發五分鐘。然後,藉由該膜將繞著灰色葡萄孢菌接種體的頂端空間與包含該殺黴菌劑的黏附盤材料密封在該井內。將該板倒置放在經處理的盤上及密封以防止任何化學藥品從盤剝脫及落到該經接

種的瓊脂上。在儲存於23°C下三天後，根據真菌菌落直徑之測量，相對於對照評估該培養物的生長百分比。實驗結果總整理在表25中。結果指示出化合物A可從數種材料揮發以類似的控制程度抑制灰色葡萄孢菌的試管內生長。

表25. 不同材料在化合物A的揮發性釋放及隨後的灰色葡萄孢菌之試管內抑制(MIC)上的效應。

材料	MIC(毫克/升)
聚乙烯	0.28
塗佈PTFE的玻璃纖維	0.56
玻璃纖維	0.56
纖維素	0.56
二氧化矽	0.56
芳族聚醯胺及玻璃纖維	0.56
塗佈乙烯基的聚酯	0.56
塗佈丙烯酸玻璃纖維	0.56
塗佈聚矽氧玻璃纖維	0.56
PTFE	1.1
硬紙板	2.2
芳族聚醯胺	2.2

實施例27

[0211]使用活體內試驗來評估化合物A控制種子的真菌生長之能力。以0.825%的NaOCl表面消毒由玉米、小麥、米、黑麥、粟及大麥組成的穀粒1分鐘，及以無菌蒸餾水洗滌三次。該等穀粒藉由將其浸泡在 1×10^6 孢子/毫升的巴西麴菌中1分鐘接種。在包含25毫升PDA的培養皿中平板接種五顆種子前，以無菌紙毛巾抹除過量接種體。為了測量效力，將化合物A在丙酮中稀釋及以劑量相依的方式將其加入至

接附至蓋子的內側之42.5毫米 Whatman #1過濾盤(目錄編號 1001-042),以達成0.4、2或10毫克/升的最後頂端空間濃度。在封閉該板及以石蠟膜密封其之前,准許該丙酮蒸發五分鐘。在23°C下培養該板三天。在儲存後,評估穀粒的菌絲菌落直徑(毫米),其結果總整理在表26中。結果闡明在此活體內分析中100%控制巴西麴菌。

表26. 10毫克/升的化合物A之頂端空間處理在控制於穀粒上的巴西麴菌生長之效應。

穀粒	在PDA上的真菌生長(毫米)		
	化合物10	對照-丙酮	對照-無丙酮
大麥	0	12.8	21.7
乾玉米	0	10.1	22.8
粟	0	7.2	19.1
米	0	7.5	21.6
黑麥	0	8.4	21
小麥	0	8.1	22.4

實施例28

[0212]爲了評估化合物A與1-甲基環丙烯(1-MCP)的組合處理,在白色玫瑰上進行活體內實驗。將五朵白色玫瑰花放置在包含200毫升常見的商業花卉防腐劑之800毫升廣口瓶中。然後,將三個廣口瓶放置在117升Rubbermaid儲存盒(CAT#2244)中。將二個小風扇放置在該容器的相對端以幫助二種揮發物的分佈。在21°C下施加500 ppb v/v1-MCP處理(AgroFresh, Springhouse, PA)24小時。在1-MCP處理完成後,對該容器排氣,及使用昇華裝置(銅管以0.5升/分鐘的風扇流加熱至200°C),以管子末端貫穿通過在該容器

中的½英吋側向孔口，以劑量相依的方式施加化合物A粉末以達成0.2、0.04或0.008毫克/升的最後頂端空間濃度，其中該孔口在施加後立即密封。在21°C下培養該花卉三天。在處理後，於21°C下評估該花卉之花瓣的疾病發生率及嚴重性額外七天。列在表27中的結果顯示出白色玫瑰花對抗灰色葡萄孢菌感染有好的抗微生物活性，及經由昇華提高揮發的比例產生較大的疾病控制。同樣地，以1-MCP處理減少花瓣掉落，如由嚴重性分數反映。

表27. 在以1-MCP處理24小時，接著在21°C下的化合物A揮發性處理三天，及在21°C下額外五天後，根據在白色玫瑰花的花瓣及萼片上之感染的灰色葡萄孢菌發生率及嚴重性。

處理	發生率(%)	嚴重性*(0-4)
對照	66.7	2.0
1-MCP	33.3	0.4
0.008毫克/升	20.0	0.2
0.04毫克/升	20.0	0.03
0.2毫克/升	0.0	0.0
0.008毫克/升+ 1-MCP	6.7	0.9
0.04毫克/升+ 1-MCP	0.0	0.0
0.2毫克/升+1-MCP	0.0	0.0

*嚴重性等級評定

0 =無疾病

1 =在萼片或花瓣上變褐色及小病灶

2 =變褐色，花瓣覆蓋真菌孢子

3 =變褐色，花瓣覆蓋真菌孢子，某些花瓣掉落

4 =變褐色，花瓣覆蓋真菌孢子，某些花卉退化

實施例29

[0213] 爲了評估化合物A與1-甲基環丙烯(1-MCP)的組合處理，在球花甘藍上進行活體內實驗。球花甘藍花以1×

10⁶孢子/毫升互生鏈格孢菌接種，然後放置在117升Rubbermaid儲存盒(Cat#2244)中，且將二個小風扇放置在該容器的相對端中。在1°C下施加500 ppb v/v1-MCP處理(AgroFresh, Springhouse, PA)24小時。在完成1-MCP處理後，移出球花甘藍小花及放置在10.8杯SnapWare氣密容器(型號#109842)中。使用昇華裝置(銅管以0.5升/分鐘的風扇流加熱至200°C)，以管子末端貫穿通過在該容器中的½英寸側向孔口，以劑量相依的方式施加化合物A粉末以達成2或0.4毫克/升的最後頂端空間濃度，其中該孔口在施加後立即密封。小花在10°C下培養五天或在21°C下三天，然後評估在21°C下的疾病發生率及嚴重性額外五天。列在表28中的結果顯示出對抗互生鏈格孢菌感染有好的抗微生物活性。

表28. 在10或21°C下處理五或三天，在21°C下額外二天，化合物A及1-MCP各別在控制球花甘藍的鏈格孢菌屬腐壞及變黃上的效應

處理(毫克/升)	21 °C		11 °C	
	嚴重性	顏色計分*	嚴重性	顏色計分
對照	1.5	2.39	0.18	1.55
1MCP	0.61	1.79	0.18	1.50
0.4毫克/升	0.29	1.32	0.00	1.75
2毫克/升	0.07	1.89	0.00	2.11
0.4毫克/升+1MCP	0.21	0.93	0.00	1.39
2毫克/升+1MCP	0.07	1.93	0.00	2.23

顏色計分等級評定

0 =綠色，勻稱外觀的球花甘藍

1 =少數淡綠色點

2 =淡綠色及黃色點

3 =淡綠色，黃色及某些棕色

4 =大部分黃色及棕色

實施例30

[0214] 爲了評估化合物A與1-甲基環丙烯(1-MCP)的組合處理，在蕃茄上進行活體內實驗。讓每顆蕃茄果實受傷三次及以 1×10^6 孢子/毫升互生鏈格孢菌接種，然後將其放置在117升Rubbermaid儲存盒(Cat #2244)中，其中將二個小風扇放置在該容器的相對端中。在21°C下施加1000 ppb v/v 1-MCP處理(AgroFresh, Springhouse, PA)24小時。在完成1-MCP處理後，移出蕃茄及將其放置在10.8杯SnapWare氣密容器(型號#109842)中。使用昇華裝置(銅管以0.5升/分鐘的風扇流加熱至200°C)，以管子末端貫穿通過在該容器中的 $\frac{1}{2}$ 英寸側向孔口，以劑量相依的方式施加化合物A粉末以達成2或0.4毫克/升的最後頂端空間濃度，其中該孔口在施加後立即密封。蕃茄在21°C下培養三天，然後在21°C下評估疾病發生率及嚴重性額外三天。列在表29中的結果顯示出蕃茄對抗互生鏈格孢菌感染有好的抗微生物活性。

表29. 在21°C下處理三天且在21°C下額外三天，化合物A及1-MCP在蕃茄上控制鏈格孢菌屬腐壞的效應

化合物A	腐壞直徑(毫米)
對照	14.8
1-MCP	13.6
0.4毫克/升	3.8
2毫克/升	0.0
0.4毫克/升+ 1-MCP	3.8
2毫克/升+ 1-MCP	0.0

實施例31

[0215] 爲了評估揮發性抗微生物化合物A及B(圖1)在果實中的活體內活性，使用蘋果、梨子、柑橘、草莓、葡萄

及藍莓展開揮發性生物鑑定。將二顆蘋果、2顆柑橘、2顆梨子、8顆草莓、16顆葡萄或30顆藍莓(每次重覆時，一式二份)放置在蚌殼包裝中，全部果實以梗末端面向上，除了草莓(梗末端面向下)外。新鮮的傷口以20微升的每毫升 1×10^6 擴展青黴菌孢子懸浮液(蘋果及梨子)、20微升的每毫升 1×10^6 指狀青黴菌孢子懸浮液(柑橘)、及20微升(草莓及葡萄)或10微升(藍莓)的每毫升 1×10^6 灰色葡萄孢菌孢子懸浮液接種。將該蚌殼包裝放在117升Rubbermaid儲存盒(CAT#2244)內及封閉蓋子。藉由昇華裝置(銅管以0.5升/分鐘的風扇流加熱至 200°C)將化合物A及B粉末引進至該容器，以達成1毫克/升的最後頂端空間濃度。然後，將該容器保持在 21°C 下三天。在處理後，讓果實保持在 21°C 下額外三天，然後評估蘋果、梨子及柑橘的疾病發生率(變褐色或水浸泡病灶的毫米直徑)及病原體芽孢產生(毫米直徑)，和草莓、葡萄及藍莓的灰色葡萄孢菌疾病發生率(%)及嚴重性(0至4)，其結果總整理在表30中。結果闡明由化合物A及B二者當施加作為揮發性殺黴菌劑時，在不同宿主上對灰色葡萄孢菌及指狀青黴菌有100%活體內抗微生物控制。

表30. 昇華化合物A及B的效應，如由在草莓、葡萄及藍莓上灰色葡萄孢菌的發生率及嚴重性、及在柑橘、蘋果及梨子上的嚴重性反映，如由在三天處理加上在 21°C 下額外三天後之水浸泡病灶、變褐色及芽孢產生描出。

處理(1毫克/升)	發生率(%)			嚴重性(0-4)		
	草莓	藍莓	葡萄	草莓	藍莓	葡萄
化合物A	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0
化合物B	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0	0.0
對照	100.0	100.0	100.0	3.9	2.5	1.9

	水浸泡病灶 變褐色(毫米)			芽孢產生(毫米)		
	柑橘	蘋果	梨子	柑橘	蘋果	梨子
化合物A	0.0	0.8	4.7	0.0	0.0	0.0
化合物B	0.0	2.3	1.1	0.2	0.0	0.0
對照	73.2	21.7	29.7	46.0	5.2	18.5

實施例32

[0216]爲了評估化合物A作爲接觸式殺黴菌劑的活性，展開試管內試驗。使用6公分直徑的培養皿。將化合物A添加進全強度馬鈴薯右旋糖瓊脂(PDA)中以達成10、2、0.4或0.08毫克/升的最後溶液濃度，及對每片板加入15毫升體積的溶液。在冷卻後，將1微升的每毫升 1×10^5 擴展青黴菌或指狀青黴菌孢子懸浮液點吸移至瓊脂中心。

[0217]以石蠟膜密封該板及將其放置在保持於23°C下的培養器中。在儲存三天後，根據真菌菌落直徑之測量，相對於對照評估該培養物的生長百分比。實驗結果總整理在表31中。結果指示出化合物A在此對抗植物真菌病原體的試管內試驗中具有作爲接觸式殺黴菌劑的活性。

表31. 化合物10作爲接觸式殺黴菌劑用於擴展青黴菌及指狀青黴菌的菌絲生長抑制之試管內MIC。

病原體	發生率(%)	
	擴展青黴菌	指狀青黴菌
比例(毫克/升)		
10	0.0	0.0
2	0.0	0.0
0.4	33.0	12.5
0.08	93.1	42.0

實施例33

[0218] 爲了評估化合物10(圖1)作爲接觸式澆灌殺黴菌劑的活性，展開活體內試驗。將二顆蘋果或2顆柑橘(每次重覆時，一式二份)放置在蚌殼包裝中，及讓每顆果實靠近赤道區域處產生三個新鮮傷口。將化合物10溶解在水中以達成250、50或10毫克/升的最後處理溶液濃度。將果實浸泡在化合物10溶液中1分鐘，及允許乾燥1小時。然後，果實傷口以30微升的每毫升 1×10^6 擴展青黴菌孢子懸浮液(蘋果)、或指狀青黴菌孢子懸浮液(柑橘)接種。然後，將蚌殼包裝放置在10.8杯SnapWare氣密容器(型號#109842)中，及在21°C下培養3天。在處理後，讓果實保持在21°C下額外3天，然後評估疾病發生率(變褐色或水浸泡病灶的毫米直徑)及病原體芽孢產生(毫米直徑)，結果總整理在表30中。結果闡明當施加作爲接觸式殺黴菌劑時對2種真菌病原體在2種不同宿主上有好的活體內抗微生物控制。

表32. 化合物A作爲接觸式殺黴菌劑各別在柑橘及蘋果上用來控制指狀青黴菌及擴展青黴菌的活體內MIC。

化合物A (毫克/升)	柑橘		蘋果	
	水浸泡 (毫米)	芽孢產生 (毫米)	變褐色 (毫米)	芽孢產生 (毫米)
對照	42.7	31.0	9.7	3.5
10	27.5	16.6	8.5	2.1
50	18.8	12.0	3.7	1.6
250	1.7	0.4	0.8	0.5

實施例34

[0219] 爲了評估化合物A作爲揮發性殺黴菌劑的活性，

展開試管內試驗來評估孢子發芽。將2毫升的水瓊脂傾倒在3.5公分培養皿中。將化合物A溶解在丙酮中以達成0.14、0.07或0.035毫克/升的最後處理溶液濃度。以1微升的每毫升 1×10^6 灰色葡萄孢菌及擴展青黴菌孢子懸浮液接種該板。然後，在0°C下培養該板一天，在0°C下五天，或在0°C下五天加上在21°C下額外一或二天。在每個時間點處，移出該板及計數100個孢子的發芽百分比，其中發芽定義為發芽管已延伸至大於孢子的長度之距離。結果總整理在表33中。在全部三種處理濃度及溫度型下，化合物A完全抑制所測試的真菌病原體孢子發芽。

表33. 灰色葡萄孢菌及擴展青黴菌孢子因應化合物10在4種不同溫度型下的揮發性處理之發芽百分比

病原體	化合物10 比例(毫克/升)	發芽抑制(%)			
		1天, 0 °C	5天, 0°C	5天, 0°C 1天, 21°C	5天, 0°C 2天, 21°C
灰色葡萄孢菌	0.14	0.0	0.0	0.0	0.0
	0.07	0.0	0.0	0.0	0.0
	0.035	0.0	0.0	0.0	0.0
	對照	44.8	98.7	92.2	98.4
	丙酮	48.9	98.9	93.9	95.8
擴展青黴菌	0.14	0.0	0.0	0.0	0.0
	0.07	0.0	0.0	0.0	0.0
	0.035	0.0	0.0	0.0	0.0
	對照	0.0	1.1	12.6	30.8
	丙酮	0.0	0.0	6.4	21.8

實施例35

[0220] 爲了評估化合物A作爲揮發性殺黴菌劑的活性，

展開試管內試驗來評估孢子發芽。以2毫升水瓊脂填充3.5公分培養皿。在冷卻後，將1微升的每毫升 1×10^5 灰色葡萄孢菌孢子懸浮液點吸移至該板的中心。

表34. 在轉移至新鮮的灰色葡萄孢菌媒質後，因應化合物A之揮發性處理的孢子發芽及隨後的菌絲生長。

化合物10 比例(毫克/升)	孢子發芽(%)		在轉移後之菌絲生長(%)
	24小時 ^a	24小時+ 24小時 ^b	3天 ^c
對照	100.0	100.0	100.0
丙酮	98.4	92.7	100.0
142.9	0.0	0.0	0.0
71.4	0.0	0.0	0.0
35.7	0.0	0.0	0.0
17.9	0.0	0.0	0.0
8.9	0.0	0.0	0.0
4.5	0.0	0.0	10.1
2.2	0.0	0.0	16.9
1.1	0.0	0.0	32.6
0.56	0.0	0.0	43.3
0.28	0.0	0.0	51.3
0.14	0.0	0.0	53.8
0.07	0.0	10.0	60.3

^a 在24小時處理後測量之孢子發芽

^b 在處理移除後之額外24小時後所測量的孢子發芽

^c 在接種體轉移至乾淨的PDA板後3天之菌絲生長百分比

[0221]在揮發性殺黴菌劑處理前，立即接種該板。將Whatman #1過濾盤(目錄編號1001-0155)放置在板蓋的底面上，一式二份。爲了測量最小抑制濃度(MIC)，在丙酮中稀釋化合物，及以劑量相依的方式將適當量的化合物加入至

盤以達成142.9至0.07毫克/升的最後頂端空間濃度。准許該丙酮蒸發五分鐘，然後將蓋子放置在板上，及以石蠟膜密封。在儲存於23°C下24小時後，計數100個孢子的發芽百分比，其中發芽定義為發芽管已延伸至大於孢子長度的距離。在計數後，移除處理及再密封該板。在額外24小時後，再次計數100個孢子。然後，將塞子轉移至包含全強度PDA的乾淨板及允許在23°C下培養額外三天。在培養後，測量菌絲生長(毫米直徑)及總整理在表34中。在24小時後，對照孢子100%已發芽，同時在此揮發性試管內試驗中，全部比例的化合物A產生100%抑制發芽。這些結果顯示出化合物A實現殺黴菌效應，如與抑真菌效應相反，如此經處理的孢子無法發芽及生長如為菌絲體，甚至在已經移除該化合物後。

【符號說明】

(無)

發明摘要

※ 申請案號：103103508

※ 申請日：103/01/29

※IPC 分類：*A01N 55/08* (2006.01)
A01P 1/00 (2006.01)
A01P 3/00 (2006.01)

【發明名稱】(中文/英文)

苯并氧雜硼在肉類、植物或植物部分上作為揮發性抗微生物劑之用途
USE OF BENZOXABOROLES AS VOLATILE ANTIMICROBIAL
AGENTS ON MEATS, PLANTS, OR PLANT PARTS

【中文】

本發明係關於一種揮發性抗微生物化合物對抗影響肉類、植物或植物部分的病原體之用途。所提供的揮發性抗微生物化合物包括某些氧雜硼化合物，例如苯并氧雜硼。提供一種傳遞系統以利用這些抗微生物化合物的揮發性本質。同樣地，本發明揭示出與揮發性植物生長調節劑例如1-甲基環丙烯之組合。

【英文】

This invention is related to use of a volatile antimicrobial compound against pathogens affecting meats, plants, or plant parts. The volatile antimicrobial compounds provided include certain oxaborole compounds for example benzoxaboroles. Delivery systems are provided to take advantage of the volatile nature of these antimicrobial compounds. Also combinations with a volatile plant growth regulator, for example 1-methylcyclopropene, are disclosed.

圖式

1/4

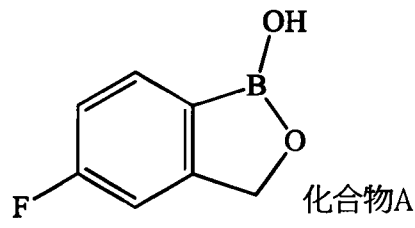


圖1

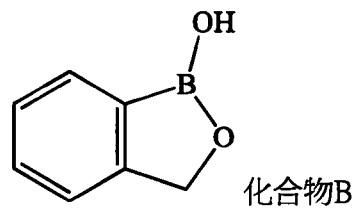


圖2

1
2
3
4

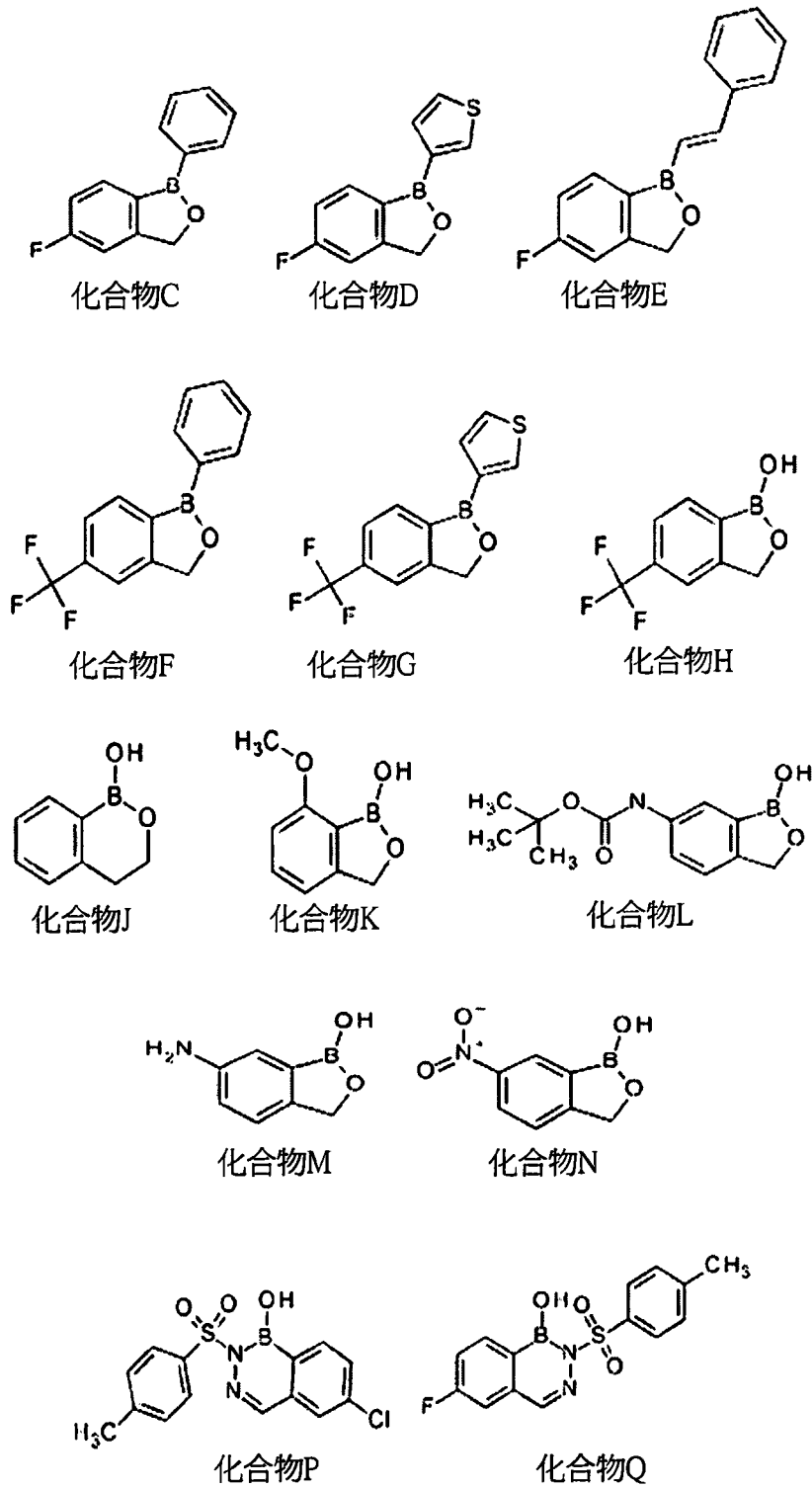


圖3

【代表圖】

【本案指定代表圖】：第（ ）圖。(無)

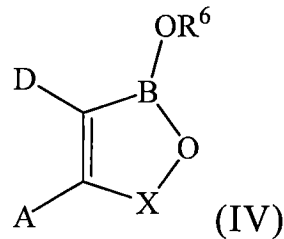
【本代表圖之符號簡單說明】：

【本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式】：

(無)

申請專利範圍

1. 一種使用揮發性抗微生物化合物對抗影響肉類、植物或植物部分的病原體之方法，其包括提供呈氣態形式的式 (IV) 之揮發性抗微生物化合物：

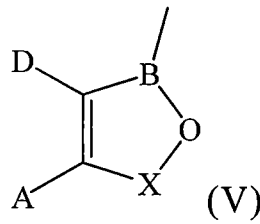


其中 A 及 D 與它們所接附的碳原子一起形成一 5、6 或 7 員稠環，其可經下列取代：C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、羥基、鹵素、硝基、腓、胺基、經一或多個 C₁-C₆-烷基取代的胺基、羧基、醯基、芳氧基、碳醯胺基、經 C₁-C₆-烷基取代的碳醯胺基、磺醯胺基或三氟甲基；或該稠環可連結二個氧雜硼環(oxaborole rings)；

X 係 -CR⁷R⁸ 基團，其中 R⁷ 及 R⁸ 各自獨立地係氫、C₁-C₆-烷基、腓、硝基、芳基、芳烷基、或 R⁷ 及 R⁸ 與它們所接附的碳原子一起形成脂環族環；及

R⁶ 係氫；C₁-C₁₈-烷基；經 C₁-C₆-烷氧基取代的 C₁-C₁₈-烷基；C₁-C₆-烷硫基；羥基；胺基；經 C₁-C₁₈-烷基取代的胺基；羧基；芳基；芳氧基；碳醯胺基；經 C₁-C₆-烷基、芳基或芳烷基取代的碳醯胺基；芳烷基；芳基；雜芳基；環烷基；C₁-C₁₈-伸烷基胺基(alkyleneamino)；經苯基、C₁-C₆-烷氧基或 C₁-C₆-烷硫基取代的 C₁-C₁₈-伸烷

基胺基；羰基伸烷基胺基；或式(V)之基團(radical)：



其中A、D及X係除了硼酞內酯(boronophthalide)以外之如前述所界定者；

及其農藝上可接受的鹽；

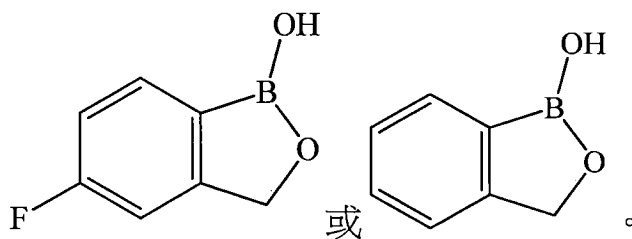
且讓肉類、植物或植物部分與有效量之該呈氣態形式的揮發性抗微生物化合物接觸。

2. 如請求項1之方法，其中該病原體係選自於由下列所組成之群：鏈格孢菌(*Alternaria* spp.)、麴菌(*Aspergillus* spp.)、葡萄座腔菌(*Botryosphaeria* spp.)、灰黴菌(*Botrytis* spp.)、絲衣黴菌(*Byssochlamys* spp.)、念珠菌(*Candida* spp.)、炭疽刺盤孢菌(*Colletotrichum* spp.)、德巴利酵母菌(*Debaryomyces* spp.)、間座殼菌(*Diaporthe* spp.)、色二孢菌(*Diplodia* spp.)、鐮孢菌(*Fusarium* spp.)、地絲菌(*Geotrichum* spp.)、小叢殼菌(*Glomerella* spp.)、毛色二孢菌(*Lasiodiplodia* spp.)、鏈核黴菌(*Monilinia* spp.)、毛黴菌(*Mucor* spp.)、青黴菌(*Penicillium* spp.)、無柄盤菌(*Pezicula* spp.)、擬莖點黴菌(*Phomopsis* spp.)、疫病菌(*Phytophthora* spp.)、腐黴菌(*Pythium* spp.)、絲核菌(*Rhizoctonia* spp.)、根黴菌(*Rhizopus* spp.)、核盤菌(*Sclerotinia* spp.)及黑星菌(*Venturia* spp.)。
3. 如請求項1之方法，其中該病原體係選自於由下列所組

成之群：伊文氏桿菌 (*Erwinia* spp.)、果膠桿菌 (*Pectobacterium* spp.)、假單胞菌 (*Pseudomonas* spp.)、羅爾斯頓氏菌 (*Ralstonia* spp.)、黃單孢桿菌 (*Xanthomonas* spp.)、沙門氏菌 (*Salmonella* spp.)、大腸桿菌 (*Escherichia* spp.)、李氏桿菌 (*Listeria* spp.)、志賀氏桿菌 (*Shigella* spp.)、葡萄球菌 (*Staphylococcus* spp.)、念珠菌 (*Candida* spp.)、德巴利酵母菌 (*Debaryomyces* spp.)、芽孢桿菌 (*Bacillus* spp.)、曲狀桿菌 (*Campylobacter* spp.)、梭狀芽孢桿菌 (*Clostridium* spp.)、隱孢子蟲 (*Cryptosporidium* spp.)、梨形鞭毛蟲 (*Giardia* spp.)、弧菌 (*Vibrio* spp.)、黃單孢桿菌 (*Xanthomonas* spp.) 及耶爾森氏菌 (*Yersinia* spp.)。

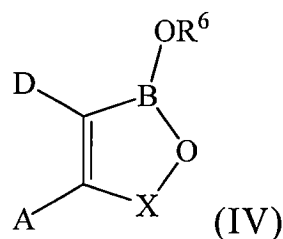
4. 如請求項1之方法，其中該方法包含選自於由下列所組成之群之處理：在田野包裝(field packing)期間之處理；在托板輸送期間或在托板輸送後，於開放式托板中或於包裹的托板中、於帳篷內之處理；在海運貨櫃、卡車或在運輸期間所使用的其它容器型式中之含或不含襯墊的盒內處理；及在儲存期間之處理。
5. 如請求項1之方法，其中該植物或植物部分係選自於由玉米、小麥、棉花、米、大豆及油菜(canola)所組成之群。
6. 如請求項1之方法，其中該植物或植物部分係選自於由果實、蔬菜、苗圃、草皮及觀賞植物(ornamental crops)所組成之群。

7. 如請求項6之方法，其中該果實係選自於由下列所組成之群：香蕉、鳳梨、柑橘屬植物、葡萄、西瓜、羅馬甜瓜(cantaloupe)、哈密瓜(muskmelon)、及其它甜瓜、蘋果、桃子、梨子、櫻桃、奇異果、芒果、油桃、番石榴、木瓜、柿子、石榴、酪梨、無花果、柑橘屬植物及漿果。
8. 如請求項7之方法，其中該漿果係選自於由草莓、藍莓、覆盆子及黑莓所組成之群。
9. 如請求項7之方法，其中該柑橘屬植物係選自於由柑橘類、檸檬、萊姆及葡萄柚所組成之群。
10. 如請求項1之方法，其中該接觸包括藉由選自於由下列所組成之群的方法施加該揮發性抗微生物化合物：噴灑、噴霧、熱或非熱霧化、澆灌、氣體處理及其組合。
11. 如請求項10之方法，其中該氣體處理係選自於由下列所組成之群：從囊袋釋放、從合成或天然膜釋放、從襯墊或其它包裝材料釋放、從粉末釋放、從氣體釋放產生器釋放、使用壓縮或非壓縮氣瓶釋放、在盒子內從小滴釋放、及其組合。
12. 如請求項1之方法，其中該揮發性抗微生物化合物具有下列結構：



13. 一種使用揮發性抗微生物化合物對抗影響肉類、植物或

植物部分的病原體之方法，其包括提供呈氣態形式的式 (IV) 之揮發性抗微生物化合物：



讓肉類、植物或植物部分與有效量之該呈氣態形式的揮發性抗微生物化合物接觸；及

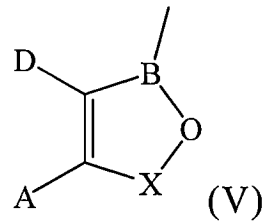
讓肉類、植物或植物部分與有效量之呈氣態形式的環丙烯化合物接觸；

其中 A 及 D 與它們所接附的碳原子一起形成一 5、6 或 7 員稠環，其可經下列取代：C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、羥基、鹵素、硝基、腈、胺基、經一或多個 C₁-C₆-烷基取代的胺基、羧基、醯基、芳氧基、碳醯胺基、經 C₁-C₆-烷基取代的碳醯胺基、磺醯胺基或三氟甲基；或該稠環可連結二個氧雜硼環；

X 係 -CR⁷R⁸ 基團，其中 R⁷ 及 R⁸ 各自獨立地係氫、C₁-C₆-烷基、腈、硝基、芳基、芳烷基、或 R⁷ 及 R⁸ 與它們所接附的碳原子一起形成脂環族環；及

R⁶ 係氫；C₁-C₁₈-烷基；經 C₁-C₆-烷氧基取代的 C₁-C₁₈-烷基；C₁-C₆-烷硫基；羥基；胺基；經 C₁-C₁₈-烷基取代的胺基；羧基；芳基；芳氧基；碳醯胺基；經 C₁-C₆-烷基、芳基或芳烷基取代的碳醯胺基；芳烷基；芳基；雜芳基；環烷基；C₁-C₁₈-伸烷基胺基；經苯基、C₁-C₆-烷

氧基或C₁-C₆-烷硫基取代的C₁-C₁₈-伸烷基胺基；羰基伸烷基胺基；或式(V)之基團：



其中A、D及X係除了硼酞內酯以外之如前述所界定者；

及其農藝上可接受的鹽。

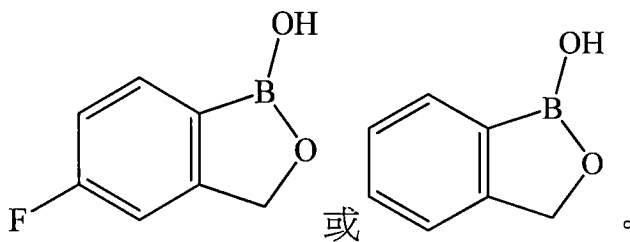
14. 如請求項13之方法，其中該病原體係選自於由下列所組成之群之至少一者：鏈格孢菌(*Alternaria* spp.)、麴菌(*Aspergillus* spp.)、芽孢桿菌(*Bacillus* spp.)、葡萄座腔菌(*Botryosphaeria* spp.)、灰黴菌(*Botrytis* spp.)、絲衣黴菌(*Byssochlamys* spp.)、曲狀桿菌(*Campylobacter* spp.)、念珠菌(*Candida* spp.)、梭狀芽孢桿菌(*Clostridium* spp.)、炭疽刺盤孢菌(*Colletotrichum* spp.)、隱孢子蟲(*Cryptosporidium* spp.)、德巴利酵母菌(*Debaryomyces* spp.)、間座殼菌(*Diaporthe* spp.)、色二孢菌(*Diplodia* spp.)、伊文氏桿菌(*Erwinia* spp.)、大腸桿菌(*Escherichia* spp.)、鐮孢菌(*Fusarium* spp.)、地絲菌(*Geotrichum* spp.)、梨形鞭毛蟲(*Giardia* spp.)、小叢殼菌(*Glomerella* spp.)、毛色二孢菌(*Lasiodiplodia* spp.)、李氏桿菌(*Listeria* spp.)、鏈核黴菌(*Monilinia* spp.)、毛黴菌(*Mucor* spp.)、果膠桿菌(*Pectobacterium* spp.)、青黴菌(*Penicillium* spp.)、無柄盤菌(*Pezicula* spp.)、擬莖點黴菌(*Phomopsis* spp.)、疫

病菌(*Phytophthora* spp.)、假單胞菌(*Pseudomonas* spp.)、腐黴菌(*Pythium* spp.)、羅爾斯頓氏菌(*Ralstonia* spp.)、絲核菌(*Rhizoctonia* spp.)、根黴菌(*Rhizopus* spp.)、沙門氏菌(*Salmonella* spp.)、核盤菌(*Sclerotinia* spp.)、志賀氏桿菌(*Shigella* spp.)、葡萄球菌(*Staphylococcus* spp.)、黑星菌(*Venturia* spp.)、弧菌(*Vibrio* spp.)、黃單孢桿菌(*Xanthomonas* spp.)及耶爾森氏菌(*Yersinia* spp.)。

15. 如請求項13之方法，其中該方法包含選自於由下列所組成之群之處理：在田野包裝期間之處理；蚌殼之處理；在托板輸送期間或在托板輸送後之處理；於開放式托板中或於包裹的托板中之處理；於帳篷內之處理；在海運貨櫃、卡車或在運輸期間所使用的其它容器型式中之含或不含襯墊的盒內之處理；及在儲存期間之處理。
16. 如請求項13之方法，其中該植物或植物部分係選自於由下列所組成之群：蘆筍、甜菜、大麥、球花甘藍(broccoli)、甘藍菜(cabbage)、胡蘿蔔、樹薯、花椰菜、芹菜、黃瓜、茄子、大蒜、葡萄藤、萵苣、菠菜、韭蔥、磨菇、洋蔥、豌豆、胡椒、甜椒、馬鈴薯、南瓜、黑麥、甘薯、笋瓜(squash)、煙草、蕃茄、四季豆、高粱、甘蔗、玉米、小麥、棉花、米、大豆、油菜、果實、蔬菜、苗圃、草皮、花卉、康乃馨、天竺葵、百合花、蘭花、玫瑰花、向日葵、觀賞花卉及觀賞植物。
17. 如請求項16之方法，其中該果實係選自於由下列所組成之群：蘋果、酪梨、香蕉、草莓、藍莓、覆盆子、黑莓、

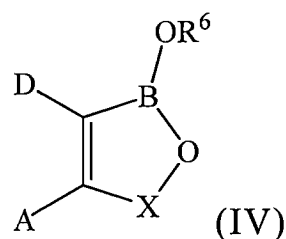
櫻桃、柑橘類、檸檬、萊姆、葡萄柚、無花果、葡萄、番石榴、奇異果、芒果、油桃、羅馬甜瓜(cantaloupe)、哈蜜瓜(muskmelon)、西瓜、木瓜、桃子、梨子、柿子、鳳梨及石榴。

18. 如請求項13之方法，其中該肉類係選自於由下列所組成之群：食用牛、野牛、雞、鹿、山羊、火雞、豬肉、羊、魚、貝類(shellfish)、軟體動物及乾醃肉產物。
19. 如請求項13之方法，其中該接觸包括藉由選自於由下列所組成之群的氣體處理施加該揮發性抗微生物化合物：從囊袋釋放、從合成或天然膜釋放、從襯墊或其它包裝材料釋放、從粉末釋放、從氣體釋放產生器釋放、使用壓縮或非壓縮氣瓶釋放、從置於盒子內之小滴或多個小滴釋放、從施用於容器內之噴霧或氣霧釋放、及其組合。
20. 如請求項13之方法，其中該揮發性抗微生物化合物具有下列結構：



21. 一種使用揮發性抗微生物化合物對抗影響肉類、植物或植物部分的病原體之方法，其包括放置肉類、植物或植物部分於一容器中；將有效量的氣態形式的式(IV)之揮發性抗微生物化合物引進該容器中，且讓該肉類、植物或

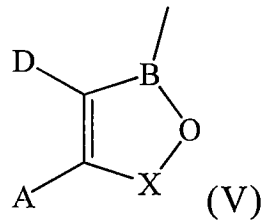
植物部分與該有效量的氣態形式的式(IV)之揮發性抗微生物化合物接觸：



其中A及D與它們所接附的碳原子一起形成一5、6或7員稠環，其可經下列取代：C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、羥基、鹵素、硝基、腓、胺基、經一或多個C₁-C₆-烷基取代的胺基、羧基、醯基、芳氧基、碳醯胺基、經C₁-C₆-烷基取代的碳醯胺基、磺醯胺基或三氟甲基；或該稠環可連結二個氧雜硼環；

X係-CR⁷R⁸基團，其中R⁷及R⁸各自獨立地係氫、C₁-C₆-烷基、腓、硝基、芳基、芳烷基、或R⁷及R⁸與它們所接附的碳原子一起形成脂環族環；及

R⁶係氫；C₁-C₁₈-烷基；經C₁-C₆-烷氧基取代的C₁-C₁₈-烷基；C₁-C₆-烷硫基；羥基；胺基；經C₁-C₁₈-烷基取代的胺基；羧基；芳基；芳氧基；碳醯胺基；經C₁-C₆-烷基、芳基或芳烷基取代的碳醯胺基；芳烷基；芳基；雜芳基；環烷基；C₁-C₁₈-伸烷基胺基；經苯基、C₁-C₆-烷氧基或C₁-C₆-烷硫基取代的C₁-C₁₈-伸烷基胺基；羧基伸烷基胺基；或式(V)之基團：



其中A、D及X係除了硼酞內酯以外之如前述所界定者；及其農藝上可接受的鹽；及

將有效量的1-甲基環丙烯(1-MCP)引進該容器中，且讓該肉類、植物、或植物部分與該有效量的1-甲基環丙烯接觸。

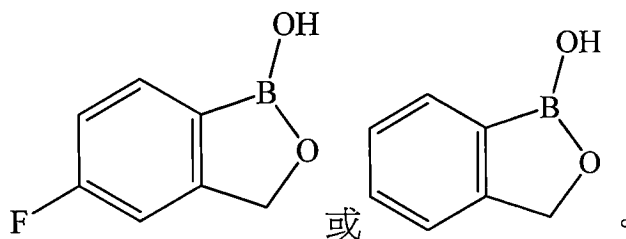
22. 如請求項21之方法，其中該方法包含選自於由下列所組成之群之處理：在田野包裝期間之處理；蚌殼之處理；在托板輸送期間或在托板輸送後之處理；於開放式托板中或於包裹的托板中之處理；於帳篷內之處理；在海運貨櫃、卡車或在運輸期間所使用的其它容器型式中之含或不含襯墊的盒內之處理；及在儲存期間之處理。
23. 如請求項21之方法，其中該植物或植物部分係選自於由下列所組成之群：蘆筍、甜菜、大麥、球花甘藍、甘藍菜、胡蘿蔔、樹薯、花椰菜、芹菜、黃瓜、茄子、大蒜、葡萄藤、萵苣、菠菜、韭蔥、磨菇、洋蔥、豌豆、胡椒、甜椒、馬鈴薯、南瓜、黑麥、甘薯、笋瓜、煙草、蕃茄、四季豆、高粱、甘蔗、玉米、小麥、棉花、米、大豆、油菜、果實、蔬菜、苗圃、草皮、花卉、康乃馨、天竺葵、百合花、蘭花、玫瑰花、向日葵、觀賞花卉及觀賞植物。
24. 如請求項23之方法，其中該果實係選自於由下列所組成

之群：蘋果、酪梨、香蕉、草莓、藍莓、覆盆子、黑莓、櫻桃、柑橘類、檸檬、萊姆、葡萄柚、無花果、葡萄、番石榴、奇異果、芒果、油桃、羅馬甜瓜、哈密瓜、西瓜、木瓜、桃子、梨子、柿子、鳳梨及石榴。

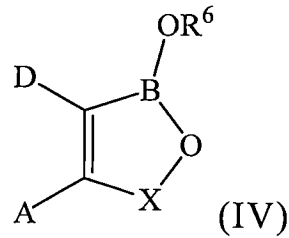
25. 如請求項21之方法，其中該肉類係選自於由下列所組成之群：食用牛、野牛、雞、鹿、山羊、火雞、豬肉、羊、魚、貝類(shellfish)、軟體動物及乾醃肉產物。

26. 如請求項21之方法，其中該接觸包括藉由選自於由下列所組成之群的氣體處理施加該揮發性抗微生物化合物：從囊袋釋放、從合成或天然膜釋放、從襯墊或其它包裝材料釋放、從粉末釋放、從氣體釋放產生器釋放、使用壓縮或非壓縮氣瓶釋放、從置於盒子內之小滴或多個小滴釋放、從施用於容器內之噴霧或氣霧釋放、及其組合。

27. 如請求項21之方法，其中該揮發性抗微生物化合物具有下列結構：



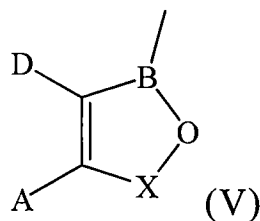
28. 一種處理植物或植物部分之方法，其包括讓植物或植物部分與一環境(atmosphere)接觸，該環境包括有效量的呈氣態形式之揮發性抗微生物化合物，其中該揮發性抗微生物化合物係式(IV)之化合物：



其中A及D與它們所接附的碳原子一起形成一5、6或7員稠環，其可經下列取代：C₁-C₆-烷基、C₁-C₆-烷氧基、羥基、鹵素、硝基、腓、胺基、經一或多個C₁-C₆-烷基取代的胺基、羧基、醯基、芳氧基、碳醯胺基、經C₁-C₆-烷基取代的碳醯胺基、磺醯胺基或三氟甲基；或該稠環可連結二個氧雜硼環；

X係-CR⁷R⁸基團，其中R⁷及R⁸各自獨立地係氫、C₁-C₆-烷基、腓、硝基、芳基、芳烷基、或R⁷及R⁸與它們所接附的碳原子一起形成脂環族環；及

R⁶係氫；C₁-C₁₈-烷基；經C₁-C₆-烷氧基取代的C₁-C₁₈-烷基；C₁-C₆-烷硫基；羥基；胺基；經C₁-C₁₈-烷基取代的胺基；羧基；芳基；芳氧基；碳醯胺基；經C₁-C₆-烷基、芳基或芳烷基取代的碳醯胺基；芳烷基；芳基；雜芳基；環烷基；C₁-C₁₈-伸烷基胺基；經苯基、C₁-C₆-烷氧基或C₁-C₆-烷硫基取代的C₁-C₁₈-伸烷基胺基；羰基伸烷基胺基；或式(V)之基團：

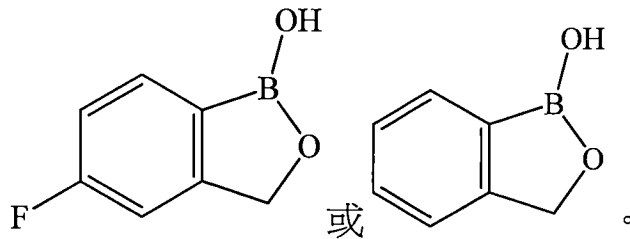


其中A、D及X係除了硼酞內酯以外之如上述所界定

者；及其農藝上可接受的鹽；及

其中該環境進一步包括有效量的 1-甲基環丙烯 (1-MCP)。

29. 如請求項 28 之方法，其中該揮發性抗微生物化合物具有下列結構：



30. 如請求項 28 之方法，其中該方法包含選自於由下列所組成之群之處理：在田野包裝期間之處理；蚌殼之處理；在托板輸送期間或在托板輸送後之處理；於開放式托板中或於包裹的托板中之處理；於帳篷內之處理；在海運貨櫃、卡車或在運輸期間所使用的其它容器型式中之含或不含襯墊的盒內之處理；及在儲存期間之處理。