



(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 I483679 B

(45) 公告日：中華民國 104 (2015) 年 05 月 11 日

(21) 申請案號：099146426

(22) 申請日：中華民國 99 (2010) 年 12 月 28 日

(51) Int. Cl. : A01N33/16 (2006.01)

A01N37/18 (2006.01)

A01P3/00 (2006.01)

(30) 優先權：2009/12/28

歐洲專利局

09356068.8

(71) 申請人：拜耳知識產權公司 (德國) BAYER INTELLECTUAL PROPERTY GMBH (DE)  
德國

(72) 發明人：貝爾 克里斯汀 BEIER, CHRISTIAN (DE)；班汀 傑拉德 BENTING, JUERGEN (DE)；伯尼爾 大衛 BERNIER, DAVID (FR)；科奎隆 皮耶 維斯 COQUERON, PIERRE-YVES (FR)；德斯柏德斯 菲利浦 DESBORDES, PHILIPPE (FR)；杜博斯特 克里斯多夫 DUBOST, CHRISTOPHE (FR)；蓋瑞 史蒂芬妮 GARY, STEPHANIE (FR)；貞尼斯 皮耶 GENIX, PIERRE (FR)；波茲 丹尼拉 PORTZ, DANIELA (DE)；瓦屈道夫 紐曼 奧瑞克 WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE (DE)

(74) 代理人：陳長文

(56) 參考文獻：

CN 1185216C

WO 2009/130193A1

審查人員：林美君

申請專利範圍項數：4 項 圖式數：0 共 120 頁

(54) 名稱

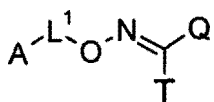
殺真菌劑肟醯基 (HYDROXIMOYL) - 雜環衍生物

FUNGICIDE HYDROXIMOYL-HETEROCYCLES DERIVATIVES

(57) 摘要

本發明係關於肟醯基(hydroximoyl)-雜環衍生物、其製備方法、其作為殺真菌劑活性劑(尤其呈殺真菌劑組合物形式)之用途、及使用該等化合物或組合物控制尤其植物之植物致病真菌之方法。

The present invention relates to hydroximoyl-heterocycle derivatives, their process of preparation, their use as fungicide active agents, particularly in the form of fungicide compositions, and methods for the control of phytopathogenic fungi, notably of plants, using these compounds or compositions.



(I)

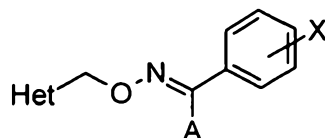
## 六、發明說明：

### 【發明所屬之技術領域】

本發明係關於肟基-雜環衍生物、其製備方法、其作為殺真菌劑活性劑、尤其呈殺真菌劑組合物形式之用途、及使用該等化合物或組合物控制尤其植物之植物致病真菌之方法。

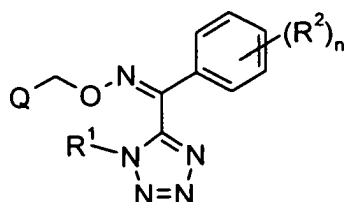
### 【先前技術】

在歐洲專利申請案EP1426371中，揭示具有下列化學結構之某些四唑肟衍生物：



其中A代表四唑基，Het代表特定吡啶基或特定噻唑基。

在日本專利申請案JP2004-131392中，揭示具有下列化學結構之某些四唑肟衍生物：



其中Q可選自15種不同雜環基團之列表。

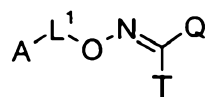
該兩個文件中所揭示之化合物並未證實可提供與本發明化合物相當之用途。

在農業中，人們一直高度關注使用新穎農藥化合物以避免或控制產生對於活性成份之抗性菌株。亦高度關注使用活性大於彼等已知化合物之新穎化合物，其目標在於降低所用活性化合物之量，同時維持至少與已知化合物等效之

功效。當前，我們已發現具有上述效應或優點之新穎化合物家族。

### 【發明內容】

因此，本發明提供式(I)之肟基-雜環衍生物

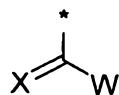


(I)

其中

○ T選自由以下組成之列表：

- 氰基，
- 式T<sup>a</sup>之基團



(T<sup>a</sup>)

其中

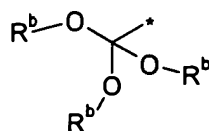
- X代表氧原子、硫原子、NR<sup>a</sup>基團；其中R<sup>a</sup>代表氫原子、硝基、羥基、氰基、胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-環烷基、經取代或未經取代之C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯基、經取代或未經取代之C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-炔基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基胺基、經取代或未經取代之二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、經取代或未經取代之C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯氧基、經取代或未經取代之C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-炔氧基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基磺醯

基、經取代或未經取代之芳基磺醯基、經取代或未經取代之苄基、經取代或未經取代之苄氧基、經取代或未經取代之苄基胺基、經取代或未經取代之苯基胺基、經取代或未經取代之芳基、或經取代或未經取代之雜環基；

- W代表氫原子、鹵素原子、羥基、氰基、胺基、氰基胺基、硫基、胼基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)氰基胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基胺基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基)-胺基、經取代或未經取代之1-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胼基、經取代或未經取代之2-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胼基、經取代或未經取代之1,2-二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胼基、經取代或未經取代之2,2-二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胼基、經取代或未經取代之三-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胼基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-環烷基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代環烷基、經取代或未經取代之C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯基、經取代或未經取代之C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-炔基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基胺基、經取代或未經取代之二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷基胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷氧基、經取代或未經取代之C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯氧基、經取代或未經取代之具

有 1 至 5 個鹵素原子之  $C_2-C_8$ -鹵代烯氧基、經取代或未  
 經取代之  $C_3-C_8$ -炔氧基、經取代或未經取代之具有 1 至 5 個  
 鹵素原子之  $C_3-C_8$ -鹵代炔氧基、經取代或未經取代之  $C_1-C_8$ -  
 烷基硫基、經取代或未經取代之  $C_1-C_8$ -烷基亞磺醯基、經取代  
 或未經取代之  $C_1-C_8$ -烷基磺醯基、經取代或未經取代之具有 1 至  
 5 個鹵素原子之  $C_1-C_8$ -鹵代烷基硫基、經取代或未經取代之具有  
 1 至 5 個鹵素原子之  $C_1-C_8$ -鹵代烷基亞磺醯基、經取代或未經  
 取代之具有 1 至 5 個鹵素原子之  $C_1-C_8$ -鹵代烷基磺醯基、經  
 取代或未經取代之芳基硫基、經取代或未經取代之芳基亞磺醯  
 基、經取代或未經取代之芳基磺醯基、經取代或未經取代之苄  
 氧基、經取代或未經取代之苄基硫基、經取代或未經取代之苄  
 基亞磺醯基、經取代或未經取代之苄基磺醯基、經取代或未經  
 取代之苄基胺基、經取代或未經取代之苯氧基、經取代或未經  
 取代之苯基胺基、經取代或未經取代之芳基、或經取代或未經  
 取代之雜環基；

- 式  $T^b$  之基團

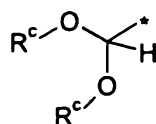


( $T^b$ )

其中

- $R^b$  獨立地代表經取代或未經取代之  $C_1-C_8$ -烷基；

- 式  $T^c$  之基團



( $T^c$ )

其中

- $R^c$  獨立地代表經取代或未經取代之  $C_1$ - $C_8$ -烷基；

- 異腈基，

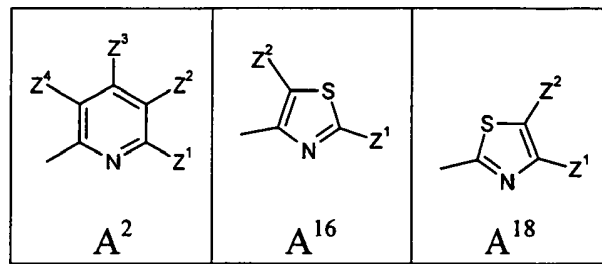
○  $L^1$  代表直接鍵或由  $-(CR^1R^2)_n$ - 組成之二價基團

其中

- $n$  代表 1、2、3 或 4；

- $R^1$  及  $R^2$  獨立地代表氫原子、鹵素原子、氰基、經取代或未經取代之  $C_1$ - $C_8$ -烷基、經取代或未經取代之  $C_3$ - $C_8$ -環烷基、經取代或未經取代之具有 1 至 5 個鹵素原子之  $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷基、經取代或未經取代之具有 1 至 5 個鹵素原子之  $C_1$ - $C_8$ -鹵代環烷基、 $C_2$ - $C_8$ -烯基、經取代或未經取代之  $C_2$ - $C_8$ -炔基、經取代或未經取代之  $C_1$ - $C_8$ -烷氧基、經取代或未經取代之具有 1 至 5 個鹵素原子之  $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷氧基、經取代或未經取代之  $C_2$ - $C_8$ -烯氧基、經取代或未經取代之具有 1 至 5 個鹵素原子之  $C_2$ - $C_8$ -鹵代烯氧基、經取代或未經取代之  $C_3$ - $C_8$ -炔氧基、或經取代或未經取代之具有 1 至 5 個鹵素原子之  $C_3$ - $C_8$ -鹵代炔氧基。

○  $A$  選自由  $A^2$ 、 $A^{16}$ 、及  $A^{18}$  組成之列表：



其中

•  $Z^1$ 、 $Z^2$ 、 $Z^3$ 、及 $Z^4$ 獨立地代表氫原子、鹵素原子、硝基、羥基、氰基、異腈基、胺基、氰基胺基、硫基、甲醯基、經取代或未經取代之 $N$ -( $C_1$ - $C_8$ -烷基)氰基胺基、甲醯基氧基、甲醯基胺基、胺甲醯基、 $N$ -羥基胺甲醯基、五氟- $\lambda^6$ -硫基、甲醯基胺基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷氧基胺基、經取代或未經取代之 $N$ -( $C_1$ - $C_8$ -烷基)- $C_1$ - $C_8$ -烷氧基胺基、經取代或未經取代之1-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之2-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之1,2-二-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之2,2-二-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之三-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之(羥基亞胺基)- $C_1$ - $C_6$ -烷基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基、經取代或未經取代之三-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)矽烷基- $C_1$ - $C_8$ -烷基、經取代或未經取代之 $C_3$ - $C_8$ -環烷基、經取代或未經取代之三-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)矽烷基- $C_3$ - $C_8$ -環烷基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_3$ - $C_8$ -鹵代環烷基、經取代或未經取代之 $C_2$ - $C_8$ -烯基、經取代或未經取代之 $C_2$ - $C_8$ -炔基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基胺

基、經取代或未經取代之二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、經取代或未經取代之(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基羰基)-胺基、經取代或未經取代之(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-環烷氧基羰基)胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷氧基、經取代或未經取代之C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯氧基、經取代或未經取代之(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯氧基羰基)胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烯氧基、經取代或未經取代之C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-炔氧基、經取代或未經取代之(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-炔氧基羰基)胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代炔氧基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基羰基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基)-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷醯亞胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基)-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷醯亞胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基羰基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基胺甲醯基、經取代或未經取代之二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胺甲醯基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)羥基胺甲醯基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基羰基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷氧基羰基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基羰基氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基羰基氧基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基羰基胺基、

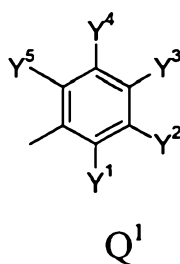


經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代  
 烷基羰基胺基、經取代或未經取代之 $C_3-C_7$ -環烷基羰基  
 胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_3$ -  
 $C_7$ -鹵代環烷基羰基胺基、經取代或未經取代之芳氧基  
 羰基胺基、經取代或未經取代之雜環基氧基羰基胺基、  
 經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基胺甲醯基胺基、經取代  
 或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基胺  
 甲醯基胺基、經取代或未經取代之二- $(C_1-C_8$ -烷基)胺甲  
 醯基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之  
 二- $(C_1-C_8$ -鹵代烷基)胺甲醯基胺基、經取代或未經取代  
 之 $N-(C_1-C_8$ -烷基)- $(C_1-C_8$ -烷基胺甲醯基)胺基、經取代  
 或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $N-(C_1-C_8$ -烷基)-  
 $(C_1-C_8$ -鹵代烷基胺甲醯基)胺基、經取代或未經取代之  
 $N-(C_1-C_8$ -烷基)- $(二-C_1-C_8$ -烷基胺甲醯基)胺基、經取代  
 或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $N-(C_1-C_8$ -烷基)-  
 $(二-C_1-C_8$ -鹵代烷基胺甲醯基)胺基、經取代或未經取代  
 之 $C_1-C_8$ -烷基胺基羰基氧基、經取代或未經取代之  
 二- $(C_1-C_8$ -烷基)胺基羰基氧基、經取代或未經取代之  
 $C_1-C_8$ -烷基胺甲硫醯基、經取代或未經取代之二- $(C_1-C_8$ -  
 烷基)胺甲硫醯基、經取代或未經取代之 $N-(C_1-C_8$ -烷基)  
 羰基胺甲硫醯基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷氧基胺  
 甲硫醯基、經取代或未經取代之 $N-(C_1-C_8$ -烷基)- $C_1-C_8$ -  
 烷氧基胺甲硫醯基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基硫  
 基胺基、經取代或未經取代之 $(C_1-C_8$ -烷氧基硫羰基)胺

基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基硫基胺基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基-胺甲硫醯基氧基、經取代或未經取代之二- $(C_1-C_8$ -烷基)-胺甲硫醯基氧基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基硫基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基硫基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基亞磺醯基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基亞磺醯基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基磺醯基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基磺醯基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基胺磺醯基、經取代或未經取代之二- $(C_1-C_8$ -烷基)胺磺醯基、經取代或未經取代之 $(C_1-C_8$ -烷氧基亞胺基)- $C_1-C_8$ -烷基、經取代或未經取代之 $(C_2-C_8$ -烯氧基亞胺基)- $C_1-C_8$ -烷基、經取代或未經取代之 $(C_2-C_8$ -炔氧基亞胺基)- $C_1-C_8$ -烷基、經取代或未經取代之(苄氧基亞胺基)- $C_1-C_8$ -烷基、經取代或未經取代之苄氧基、經取代或未經取代之苄基硫基、經取代或未經取代之苄基胺基、經取代或未經取代之苯氧基、經取代或未經取代之苯基硫基、經取代或未經取代之苯基胺基、經取代或未經取代之芳基、經取代或未經取代之芳基羰基胺基、經取代或未經取代之雜環基羰基胺基、經取代或未經取代之芳基- $C_1-C_8$ -烷基、經取代或未經取代之三- $(C_1-C_8$ -烷基)-矽烷基氧基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基硫基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基硫基胺

基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基亞磺醯基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基亞磺醯基胺基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基磺醯基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基磺醯基胺基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷氧基磺醯基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代氧基磺醯基胺基、經取代或未經取代之三- $(C_1-C_8$ -烷基)-矽烷基、經取代或未經取代之 $(C_1-C_8$ -亞烷基胺基)氧基、經取代或未經取代之 $(C_3-C_8$ -亞烯基胺基)氧基、經取代或未經取代之 $(C_3-C_8$ -亞炔基胺基)氧基、經取代或未經取代之(亞苺基胺基)氧基、經取代或未經取代之芳基-環丙基羰基胺基、經取代或未經取代之 $C_3-C_8$ -環烯基羰基胺基、經取代或未經取代之 $C_2-C_8$ -烯基羰基胺基、經取代或未經取代之 $C_2-C_8$ -炔基羰基胺基、經取代或未經取代之 $C_5-C_{12}$ -稠合雙環烷基羰基胺基、或經取代或未經取代之 $C_5-C_{12}$ -稠合雙環烯基羰基胺基；

○ Q選自由 $Q^1$ 組成之列表：



其中

•  $Y^1$ 至 $Y^5$ 獨立地代表氫原子、硝基、羥基、氰基、異腈

基、胺基、硫基、甲醯基、甲醯基氧基、甲醯基胺基、胺甲醯基、N-羥基胺甲醯基、五氟- $\lambda^6$ -硫基、甲醯基胺基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷氧基胺基、經取代或未經取代之N-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)- $C_1$ - $C_8$ -烷氧基胺基、經取代或未經取代之1-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之2-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之1,2-二-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之2,2-二-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之三-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之(羥基亞胺基)- $C_1$ - $C_6$ -烷基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基、經取代或未經取代之三-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)矽烷基- $C_1$ - $C_8$ -烷基、經取代或未經取代之 $C_3$ - $C_7$ -環烷基、經取代或未經取代之三-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)矽烷基- $C_3$ - $C_7$ -環烷基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_3$ - $C_7$ -鹵代環烷基、 $C_2$ - $C_8$ -烯基、經取代或未經取代之 $C_2$ - $C_8$ -炔基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基胺基、經取代或未經取代之二-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胺基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷氧基、經取代或未經取代之 $C_2$ - $C_8$ -烯氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_2$ - $C_8$ -鹵代烯氧基、經取代或未經取代之 $C_3$ - $C_8$ -炔氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_3$ - $C_8$ -鹵代炔氧基、經取代或未經取代之 $C_1$ -

C<sub>8</sub>-烷基羰基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基)-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷醯亞胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基)-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷醯亞胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基羰基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基胺甲醯基、經取代或未經取代之二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胺甲醯基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)羰基胺甲醯基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基羰基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷氧基羰基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基羰基氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基羰基氧基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基羰基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基羰基胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基)胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基胺甲醯基)胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基胺甲醯基)胺基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-

$C_8$ -烷基)-[二-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胺甲醯基]胺基、經取代或未  
 經取代之具有1至5個鹵素原子之N-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)-  
 [二-( $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷基)胺甲醯基]胺基、經取代或未經  
 取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基胺基羰基氧基、經取代或未經取代  
 之二-( $C_1$ - $C_8$ -烷基胺基)羰基氧基、經取代或未經取代  
 之 $C_1$ - $C_8$ -烷基胺甲硫醯基、經取代或未經取代之  
 二-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胺甲硫醯基、經取代或未經取代之N-  
 ( $C_1$ - $C_8$ -烷基)羥基胺甲硫醯基、經取代或未經取代之  
 $C_1$ - $C_8$ -烷氧基胺甲硫醯基、經取代或未經取代之N-  
 ( $C_1$ - $C_8$ -烷基)- $C_1$ - $C_8$ -烷氧基胺甲硫醯基、經取代或未  
 經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基硫基胺基、經取代或未經取代之  
 具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷基硫基胺基、經  
 取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基-胺甲硫醯基氧基、經取  
 代或未經取代之二-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)-胺甲硫醯基氧基、  
 經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基硫基、經取代或未經  
 取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷基硫基、  
 經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基亞磺醯基、經取代或  
 未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷基亞  
 磺醯基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基磺醯基、經  
 取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代  
 烷基磺醯基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基胺磺醯  
 基、經取代或未經取代之二-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胺磺醯基、  
 經取代或未經取代之( $C_1$ - $C_8$ -烷氧基亞胺基)- $C_1$ - $C_8$ -烷  
 基、經取代或未經取代之( $C_2$ - $C_8$ -烯氧基亞胺基)- $C_1$ -

$C_8$ -烷基、經取代或未經取代之( $C_3$ - $C_8$ -炔氧基亞胺基)- $C_1$ - $C_8$ -烷基、經取代或未經取代之(苄氧基亞胺基)- $C_1$ - $C_8$ -烷基、經取代或未經取代之苄氧基、經取代或未經取代之苄基硫基、經取代或未經取代之苄基胺基、經取代或未經取代之苯氧基、經取代或未經取代之苯基硫基、經取代或未經取代之苯基胺基、經取代或未經取代之芳基、經取代或未經取代之芳基- $C_1$ - $C_8$ -烷基、經取代或未經取代之三-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)-矽烷基氧基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基硫基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷基硫基胺基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基亞磺醯基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷基亞磺醯基胺基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基磺醯基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷基磺醯基胺基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基氧基磺醯基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代氧基磺醯基胺基、經取代或未經取代之三-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)-矽烷基、經取代或未經取代之( $C_1$ - $C_8$ -亞烷基胺基)氧基、經取代或未經取代之( $C_1$ - $C_8$ -亞烯基胺基)氧基、經取代或未經取代之( $C_1$ - $C_8$ -亞炔基胺基)氧基、或經取代或未經取代之(亞苄基胺基)氧基；

以及其鹽、N-氧化物、金屬複合物及非金屬複合物或其(E)及(Z)異構體及混合物。

## 【實施方式】

端視化合物中之立體單元(如藉由IUPAC規則所定義)的數量，本發明化合物中之任一者皆可以一或多種立體異構體形式存在。本發明由此等效地係關於所有立體異構體、及所有可能立體異構體之混合物(以所有比例)。立體異構體可按照熟習此項技術者本身所習知之方法予以分離。

應注意，式(I)之雜環肟衍生物中存在之肟部分的立體結構包含(E)或(Z)異構體，且該等立體異構體形成本發明之一部分。

根據本發明，下列一般術語通常按下列含義使用：

- 鹵素意指氟、氯、溴或碘；
- 雜原子可為氮、氧或硫；
- 除非另有所指，否則根據本發明經取代之基團或取代基可經一或多個下列基團或原子取代：鹵素原子、硝基、羥基、氰基、異腈基、胺基、硫基、五氟- $\lambda^6$ -硫基、甲醯基、甲醯基氧基、甲醯基胺基、胺甲醯基、N-羥基胺甲醯基、甲醯基胺基、(羥基亞胺基)-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基、三-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)矽烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-環烷基、三-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)矽烷基-C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-環烷基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-鹵代環烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-環烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-鹵代環烷氧基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-環烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、具有1至5個鹵素原子之C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-鹵代環烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-炔基、C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-



烯氧基、 $C_3-C_8$ -炔氧基、 $C_1-C_8$ -烷基胺基、二- $(C_1-C_8$ -烷基)胺基、 $C_1-C_8$ -烷氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷氧基、 $C_2-C_8$ -烯氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_2-C_8$ -鹵代烯氧基、 $C_3-C_8$ -炔氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_3-C_8$ -鹵代炔氧基、 $C_1-C_8$ -烷基羰基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基羰基、 $C_1-C_8$ -烷基胺甲醯基、二- $(C_1-C_8$ -烷基)胺甲醯基、 $N-(C_1-C_8$ -烷基)羥基胺甲醯基、 $C_1-C_8$ -烷氧基胺甲醯基、 $N-(C_1-C_8$ -烷基)- $C_1-C_8$ -烷氧基胺甲醯基、 $C_1-C_8$ -烷氧基羰基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷氧基羰基、 $C_1-C_8$ -烷基羰基氧基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基羰基氧基、 $C_1-C_8$ -烷基羰基胺基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基羰基胺基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷氧基羰基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷氧基羰基胺基、 $C_1-C_8$ -烷基胺基羰基氧基、二- $(C_1-C_8$ -烷基)胺基羰基氧基、 $C_1-C_8$ -烷基氧基羰基氧基、 $C_1-C_8$ -烷基硫基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基硫基、 $C_1-C_8$ -烷基亞磺醯基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基亞磺醯基、 $C_1-C_8$ -烷基磺醯基、具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基磺醯基、 $C_1-C_8$ -烷基胺磺醯基、二- $(C_1-C_8$ -烷基)胺磺醯基、 $(C_1-C_8$ -烷氧基亞胺基)- $C_1-C_8$ -烷基、 $(C_2-C_6$ -烯氧基亞胺基)- $C_1-C_8$ -烷基、 $(C_3-C_6$ -炔氧基亞胺基)- $C_1-C_8$ -烷基、 $($ 苄氧基亞胺基)- $C_1-C_8$ -烷基、 $C_1-C_8$ -烷氧基烷基、具有1至5個鹵素原子之

C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷氧基烷基、苄氧基、苄硫基、苄基胺基、苯氧基、苯基硫基、或苯基胺基；

- 術語「芳基」意指苯基或萘基；
- 術語「雜環基」意指包括至多4個選自由N、O、S組成之列表之雜原子的飽和或不飽和、單環或稠合雙環4-、5-、6-、7-、8-、9-、或10-員環；
- 在胺基或任一其他包括胺基之基團之胺基部分經兩個可相同或不同的取代基取代之情形下，該兩個取代基與其所連接之氮原子一起可形式雜環基、較佳5-至7員雜環基，該等雜環基可經取代或可包含其他雜原子，例如嗎啉基或六氫吡啶基。

本發明之較佳式(I)化合物係彼等T代表氟基或式T<sup>a</sup>之基團者。

本發明之較佳式(I)化合物係彼等X代表氧原子者。

本發明之其他較佳式(I)化合物係彼等R<sup>a</sup>代表氫原子、羥基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、經取代或未經取代之C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-環烷基者。

本發明之其他較佳式(I)化合物係彼等R<sup>a</sup>獨立地代表氫原子、甲基或乙基者。

本發明之其他較佳式(I)化合物係彼等如下化合物：其中W代表氫原子、鹵素原子、羥基、氟基、胺基、氟基胺基、硫基、胼基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)氟基胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基胺基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基胺基、經取代

或未經取代之1-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胼基、經取代或未經取代之2-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胼基、經取代或未經取代之1,2-二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胼基、經取代或未經取代之2,2-二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胼基、經取代或未經取代之三-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胼基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>-環烷基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基胺基、經取代或未經取代之二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫基。

本發明之其他更佳式(I)化合物係彼等如下化合物：其中W代表羥基、胺基、胼基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基胺基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基胺基、經取代或未經取代之二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫基。

本發明之其他甚至更佳式(I)化合物係彼等W代表羥基、胺基、胼基、甲基胺基、乙基胺基、二甲基胺基、乙基甲基胺基或甲氧基者；

本發明之其他較佳式(I)化合物係彼等R<sup>b</sup>代表甲基或乙基者。

本發明之其他較佳式(I)化合物係彼等R<sup>c</sup>代表甲基或乙基者。

本發明之其他較佳式(I)化合物係彼等L<sup>1</sup>代表直接鍵或由-(CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>)<sub>n</sub>-組成之二價基團者，其中

- n代表1或2；
- $R^1$ 及 $R^2$ 獨立地代表氫原子、鹵素原子、氰基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -環烷基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代環烷基、 $C_2-C_8$ -烯基、經取代或未經取代之 $C_2-C_8$ -炔基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷氧基、經取代或未經取代之 $C_2-C_8$ -烯氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_2-C_8$ -鹵代烯氧基、經取代或未經取代之 $C_3-C_8$ -炔氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_3-C_8$ -鹵代炔氧基。

本發明之其他更佳式(I)化合物係彼等 $L^1$ 代表直接鍵或由 $-(CR^1R^2)-$ 組成之二價基團者，其中 $R^1$ 及 $R^2$ 獨立地選自由以下組成之列表：氫、鹵素、甲基、乙基、異丙基、三氟甲基、二氟甲基、烯丙基、乙炔基、炔丙基、環丙基、甲氧基、三氟甲氧基及氰基。

本發明之其他較佳式(I)化合物係彼等 $Z^1$ 獨立地代表以下基團者：氫原子、鹵素原子、硝基、羥基、氰基、胺基、甲醯基胺基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基、經取代或未經取代之 $C_2-C_8$ -烯基、經取代或未經取代之 $C_2-C_8$ -炔基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基胺基、經取代或未經取代之 $(C_1-C_8$ -烷氧基羰基)胺基、經取代或未經取代之 $(C_3-C_8$ -環烷氧基羰基)胺基、經取代或未經取代之 $(C_2-C_8$ -烯氧

基羰基)胺基、經取代或未經取代之(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-炔氧基羰基)胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基胺甲醯基、經取代或未經取代之二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胺甲醯基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)羥基胺甲醯基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基羰基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基羰基胺基、經取代或未經取代之芳氧基羰基胺基、經取代或未經取代之雜環基氧基羰基胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫基胺基、經取代或未經取代之(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基硫羰基)胺基、經取代或未經取代之(芳基羰基)胺基、經取代或未經取代之(雜環基羰基)-胺基、經取代或未經取代之芳基環丙基羰基胺基、經取代或未經取代之C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-環烯基羰基胺基、經取代或未經取代之C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯基羰基胺基、經取代或未經取代之C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-炔基羰基胺基、經取代或未經取代之C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>-稠合雙環烷基羰基胺基、經取代或未經取代之C<sub>5</sub>-C<sub>12</sub>-稠合雙環烯基羰基胺基。

本發明之其他更佳式(I)化合物係彼等如下化合物：其中Z<sup>1</sup>代表胺基、甲醯基胺基、經取代或未經取代之(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基羰基)胺基、經取代或未經取代之(C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯氧基羰基)胺基、經取代或未經取代之(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-炔氧基羰基)胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫基胺基、經取代或未經取代之(芳基羰基)胺基、經取代或未經取代之(雜環基羰基)

胺基、經取代或未經取代之芳基-環丙基羰基胺基、經取代或未經取代之 $C_3$ - $C_7$ -環烯基羰基胺基、經取代或未經取代之 $C_2$ - $C_8$ -烯基羰基胺基、經取代或未經取代之 $C_2$ - $C_8$ -炔基羰基胺基。

本發明之其他甚至更佳式(I)化合物係彼等如下化合物：其中 $Z^1$ 代表胺基、甲醯基胺基、經取代或未經取代之( $C_4$ - $C_8$ -烷氧基羰基)胺基、經取代或未經取代之( $C_4$ - $C_8$ -烯氧基羰基)胺基、經取代或未經取代之( $C_4$ - $C_8$ -炔氧基羰基)胺基、經取代或未經取代之 $C_4$ - $C_8$ -烷基硫基胺基、經取代或未經取代之(芳基羰基)胺基、經取代或未經取代之(雜環基羰基)胺基。

本發明之其他較佳式(I)化合物係彼等如下化合物：其中 $Z^2$ 至 $Z^4$ 獨立地代表氫原子、鹵素原子、氰基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基、經取代或未經取代之 $C_3$ - $C_7$ -環烷基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷基、經取代或未經取代之 $C_2$ - $C_8$ -烯基、經取代或未經取代之 $C_2$ - $C_8$ -炔基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷氧基、經取代或未經取代之苯氧基、經取代或未經取代之芳基、經取代或未經取代之芳基- $C_1$ - $C_8$ -烷基。

本發明之其他更佳式(I)化合物係彼等 $Z^2$ 至 $Z^4$ 獨立地選自由以下組成之列表者：氫、鹵素、甲基、乙基、異丙基、異丁基、第三丁基、三氟甲基、二氟甲基、烯丙基、乙炔基、炔丙基、環丙基、甲氧基、三氟甲氧基、乙醯基、及

氰基。

本發明之其他較佳式(I)化合物係彼等如下化合物：Y<sup>1</sup>至Y<sup>5</sup>獨立地代表氫原子、鹵素原子、氰基、胺基、硫基、五氟-λ<sup>6</sup>-硫基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、經取代或未經取代之三-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)矽烷基-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、經取代或未經取代之C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-環烷基、經取代或未經取代之三-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)矽烷基-C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-環烷基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代環烷基、經取代或未經取代之C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯基、經取代或未經取代之C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-炔基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷氧基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基硫基、經取代或未經取代之C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-烯氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烯氧基、經取代或未經取代之C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-炔氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代炔氧基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基羰基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基)-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷醯亞胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基)-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷醯亞胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基羰基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基胺甲醯基、經取代或未經取代之二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胺甲醯基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)羥基胺甲醯基、經取

代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷氧基胺甲醯基、經取代或未經取代之 $N-(C_1-C_8-烷基)-C_1-C_8-烷氧基胺甲醯基$ 、經取代或未經取代之 $C_1-C_8-烷氧基羰基$ 、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8-鹵代烷氧基羰基$ 、經取代或未經取代之 $C_1-C_8-烷基胺甲硫醯基$ 、經取代或未經取代之二- $(C_1-C_8-烷基)胺甲硫醯基$ 、經取代或未經取代之 $N-(C_1-C_8-烷基)羰基胺甲硫醯基$ 、經取代或未經取代之 $C_1-C_8-烷氧基胺甲硫醯基$ 、經取代或未經取代之 $N-(C_1-C_8-烷基)-C_1-C_8-烷氧基胺甲硫醯基$ 、經取代或未經取代之 $C_1-C_8-烷基硫基$ 、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8-鹵代烷基硫基$ 、經取代或未經取代之 $C_1-C_8-烷基磺醯基$ 、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8-鹵代烷基磺醯基$ 、經取代或未經取代之 $(C_1-C_8-烷氧基亞胺基)-C_1-C_8-烷基$ 、經取代或未經取代之 $(C_2-C_8-烯氧基亞胺基)-C_1-C_8-烷基$ 、經取代或未經取代之 $(C_3-C_8-炔氧基亞胺基)-C_1-C_8-烷基$ 、經取代或未經取代之 $(苄氧基亞胺基)-C_1-C_8-烷基$ 、經取代或未經取代之苄氧基、經取代或未經取代之苄基硫基、經取代或未經取代之苯氧基、經取代或未經取代之苯基硫基、經取代或未經取代之芳基、經取代或未經取代之芳基- $C_1-C_8-烷基$ 、經取代或未經取代之三- $(C_1-C_8-烷基)-矽烷基氧基$ 、經取代或未經取代之三- $(C_1-C_8-烷基)-矽烷基$ 。

本發明之其他更佳式(I)化合物係彼等如下化合物：其中 $Y^1$ 至 $Y^5$ 獨立地代表氫原子、鹵素原子、甲基、異丙基、異丁基、第三丁基、三氟甲基、二氟甲基、烯丙基、乙炔



基、炔丙基、環丙基、甲氧基、三氟甲氧基及氰基。

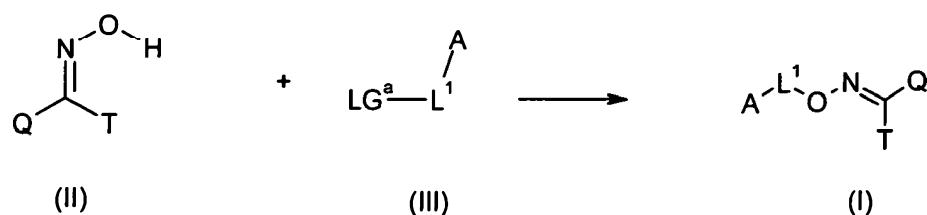
本發明式(I)化合物之上述較佳取代基可以各種方式進行組合。較佳特徵之該等組合由此提供本發明化合物之子類。本發明較佳化合物之該等子類的實例可組合：

- A之較佳特徵與L<sup>1</sup>、T、X及Q中一或多者之較佳特徵；
- X之較佳特徵與L<sup>1</sup>、T、A及Q中一或多者之較佳特徵；
- L<sup>1</sup>之較佳特徵與A、T、X及Q中一或多者之較佳特徵；
- T之較佳特徵與A、L<sup>1</sup>、X及Q中一或多者之較佳特徵；
- Q之較佳特徵與A、L<sup>1</sup>、X及T中一或多者之較佳特徵；

在本發明化合物之取代基之較佳特徵的該等組合中，該等較佳特徵亦可選自A、X、L<sup>1</sup>、T及Q中每一者之更佳特徵；從而可形成最佳之本發明化合物子類。

本發明化合物之其他取代基之較佳特徵亦可為本發明較佳化合物之該等子類的一部分，尤其係取代基T<sup>a</sup>、T<sup>b</sup>、T<sup>c</sup>、X、W、R<sup>a</sup>、R<sup>b</sup>、R<sup>c</sup>、n、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、Z<sup>1</sup>至Z<sup>4</sup>、及Y<sup>1</sup>至Y<sup>5</sup>之基團。

本發明亦係關於製備式(I)化合物之方法。因此，根據本發明另一態樣，提供製備如本文所定義之式(I)化合物之方法P1，如下列反應圖所示：



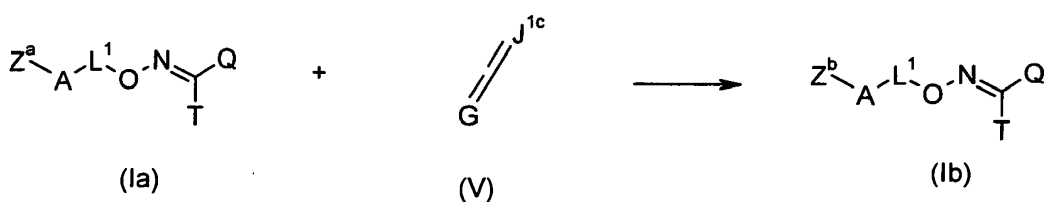
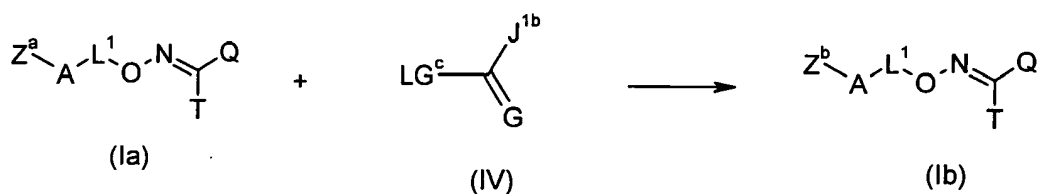
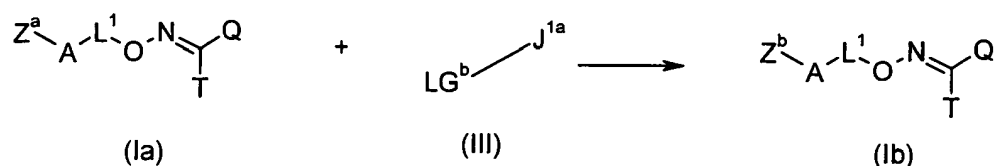
#### 方法 P1

其中T、A、Q及L<sup>1</sup>如本文所定義且LG<sup>a</sup>代表離去基團。

適宜離去基團可選自由鹵素原子或其他常用離核基團(例如三氟甲磺酸根、甲磺酸根、或甲苯磺酸根)組成之列表。

對於本發明之式(Ia)化合物，在 $Z^1$ 、 $Z^2$ 、 $Z^3$ 、或 $Z^4$ 代表羥基、硫基、胺基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷基胺基、甲醯基胺基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷氧基胺基、經取代或未經取代之1-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之2-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之1,2-二-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之2,2-二-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基羰基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷基羰基胺基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷氧基羰基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷氧基羰基胺基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷基胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之二-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之 $C_1$ - $C_8$ -烷基硫基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1$ - $C_8$ -鹵代烷基硫基胺基、經取代或未經取代之( $C_1$ - $C_8$ -烷基-胺甲硫醯基)-胺基、經取代或未經取代之[二-( $C_1$ - $C_8$ -烷基)-胺甲硫醯基]-胺基時，可根據已知方法藉由另一步驟(包括此基團之額外修飾，尤其藉由以下反應：烷基化、醯化、烷氧基羰基化、烷基胺基羰基化及烷基胺

基硫羰基化)來完成本發明之方法P1以得到式(Ib)化合物。  
 在此一情形下，提供本發明之方法P2且此一方法P2可藉由  
 下列反應圖進行例示：



### 方法 P2

其中

- T、A、Q及L<sup>1</sup>如本文所定義，LG<sup>b</sup>及LG<sup>c</sup>代表離去基團，J<sup>1a</sup>視需要代表經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基，J<sup>1b</sup>視需要代表氫原子、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基胺基、經取代或未經取代之二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷氧基，J<sup>1c</sup>視需要代表經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基

胺基；

- $Z^a$ 代表羥基、硫基、胺基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基胺基、甲醯基胺基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷氧基胺基、經取代或未經取代之1-( $C_1-C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之2-( $C_1-C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之1,2-二-( $C_1-C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之2,2-二-( $C_1-C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基羰基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基羰基胺基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷氧基羰基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷氧基羰基胺基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之二-( $C_1-C_8$ -烷基)胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基硫基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基硫基胺基、經取代或未經取代之( $C_1-C_8$ -烷基-胺甲硫醯基)-胺基、經取代或未經取代之[二-( $C_1-C_8$ -烷基)-胺甲硫醯基]-胺基，

- G代表氧原子或硫原子；

- $Z^b$ 代表甲醯基氧基、甲醯基胺基、經取代或未經取代之N-( $C_1-C_8$ -烷基)- $C_1-C_8$ -烷氧基胺基、經取代或未經取代之1,2-二-( $C_1-C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之2,2-二-( $C_1-C_8$ -烷基)胼基、經取代或未經取代之三-( $C_1-C_8$ -烷基)胼

基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基胺基、經取代或未經取代之二- $(C_1-C_8$ -烷基)胺基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷氧基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基硫基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基硫基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基羰基氧基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基羰基氧基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基羰基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基羰基胺基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷氧基羰基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷氧基羰基胺基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $C_1-C_8$ -鹵代烷基胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之二- $(C_1-C_8$ -烷基)胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之二- $(C_1-C_8$ -鹵代烷基)胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之 $N-(C_1-C_8$ -烷基)- $(C_1-C_8$ -烷基胺甲醯基)胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $N-(C_1-C_8$ -鹵代烷基)- $(C_1-C_8$ -鹵代烷基胺甲醯基)胺基、經取代或未經取代之 $N-(C_1-C_8$ -鹵代烷基)-二- $(C_1-C_8$ -鹵代烷基)胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之 $N-(C_1-C_8$ -鹵代烷基)-二- $(C_1-C_8$ -鹵代烷基)胺甲醯基胺基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基胺基羰基氧基、經取代或未經取代之二- $(C_1-C_8$ -鹵代烷基)胺基羰基氧基、經取代或未經取代之 $C_1-C_8$ -烷基胺甲硫醯

基、經取代或未經取代之二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胺甲硫醯基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)羥基胺甲硫醯基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基胺甲硫醯基、經取代或未經取代之N-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)-C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基胺甲硫醯基、經取代或未經取代之(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基-胺甲硫醯基)-胺基、經取代或未經取代之[二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)-胺甲硫醯基]-胺基、經取代或未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基硫基、經取代或未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基硫基、經取代或未經取代之苄氧基、經取代或未經取代之苄基硫基、經取代或未經取代之苄基胺基、經取代或未經取代之三-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)-矽烷基氧基。

- 適宜離去基團可選自由鹵素原子或其他常用離核基團(例如烷氧基、烷基硫基、氫氧化物、氰化物、三氟甲磺酸根、甲磺酸根、或甲苯磺酸根)組成之列表。

若Z<sup>1</sup>、Z<sup>2</sup>、Z<sup>3</sup>、或Z<sup>4</sup>代表經保護之胺基，則方法P2之實施預先需要去保護步驟以得到胺基。熟習此項技術者已熟知胺基保護基團及其相關解離方法。

根據本發明，方法P1及P2可(若適宜)在溶劑存在下及(若適宜)在鹼存在下實施。

根據本發明，方法P1及P2可(若適宜)在觸媒存在下實施。適宜觸媒可選自4-(二甲基胺基)吡啶、1-羥基苯并三唑或二甲基甲醯胺。

在LG<sup>c</sup>代表羥基之情形下，本發明之方法P2可在縮合劑存在下實施。適宜縮合劑可選自醯鹵形成劑，例如光氣、

三溴化磷、三氯化磷、五氯化磷、氧三氯化磷或亞硫醯氯；酞形成劑，例如氯甲酸乙酯、氯甲酸甲酯、氯甲酸異丙酯、氯甲酸異丁酯或甲磺醯氯；碳化二亞胺，例如N,N'-二環己基碳化二亞胺(DCC)；或其他常用縮合劑，例如五氧化磷、聚磷酸、N,N'-羰基-二咪唑、2-乙氧基-N-乙氧基羰基-1,2-二氫喹啉(EEDQ)、三苯基磷/四氯甲烷、水合氯化4-(4,6-二甲氧基[1.3.5]-三嗪-2-基)-4-甲基嗎啉鎘或六氟磷酸溴-三吡咯啶基-鎘。

用於實施本發明之方法P1及P2的適宜溶劑係常用惰性有機溶劑。較佳使用視需要經鹵化之脂肪族、脂環族或芳族烴，例如石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫化萘、氯苯、二氯苯、三氯甲苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚，例如二乙醚、二異丙基醚、甲基第三-丁基醚、甲基第三-戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚；腈，例如乙腈、丙腈、正-或異-丁腈或苄腈；醯胺，例如N,N-二甲基甲醯胺、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲醯苯胺、N-甲基吡咯啶酮或六甲基磷酸三醯胺；酯，例如乙酸甲酯或乙酸乙酯；亞砜，例如二甲基亞砜；或砜，例如環丁砜。

用於實施本發明之方法P1及P2之適宜鹼係常用於該等反應的無機及有機鹼。較佳使用鹼土金屬、鹼金屬氫化物、鹼金屬氫氧化物或鹼金屬醇鹽(例如氫氧化鈉、氫化鈉、氫氧化鈣、氫氧化鉀、第三-丁醇鉀或其他氫氧化銨)、鹼

金屬碳酸鹽(例如碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鉀、碳酸氫鈉、碳酸鈹)、鹼金屬或鹼土金屬乙酸鹽(例如乙酸鈉、乙酸鉀、乙酸鈣)、以及三級胺(例如三甲基胺、三乙基胺、二異丙基乙基胺、三丁基胺、N,N-二甲基苯胺、吡啶、N-甲基六氫吡啶、N,N-(二甲基胺基)吡啶、1,4-二氮雜雙環[2.2.2]辛烷(DABCO)、1,5-二氮雜雙環[4.3.0]壬-5-烯(DBN)或1,8-二氮雜雙環[5.4.0]十一-7-烯(DBU))。

在實施本發明之方法P1及P2時，反應溫度可在相對寬範圍內獨立地變化。通常，本發明之方法P1係在-80°C至160°C之溫度下實施。控制本發明之方法P1及P2之溫度的方式係使用微波技術。

本發明之方法P1及P2通常係在大氣壓下獨立地實施。然而，亦可在高壓或減壓下操作。

藉由常用方法來實施作業。通常，使用水處理反應混合物且分離出有機相，並在乾燥之後在減壓下濃縮。若適宜，可藉由常用方法(例如層析或重結晶)使剩餘殘餘物與可能仍存在之任何雜質分離。

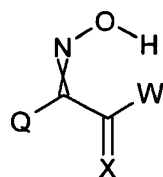
本發明化合物可根據上述方法製得。然而，應理解，根據一般知識及可用公開案，熟習此項技術者能夠根據期望合成之每一本發明化合物的具體細節來修改該等方法。

用作起始材料之式(II)化合物可藉由(例如)以下方式製得：根據F.Heaney等人(Organic and Biomolecular Chemistry 2003, 7, 1122)所闡述之方法使羥胺與相應酮進行反應，或根據Y.Kondo等人(Bioscience, Biotechnology, and



Biochemistry 2007, 71, 2781)所闡述之方法使亞硝酸烷基酯與相應苳基之亞甲基進行反應。

在另一態樣中，本發明係關於用作用於本發明製備方法之中間體化合物或材料的式(IIa)化合物。本發明由此提供式(IIa)之化合物：



(IIa)

其中Q係經取代或未經取代之苳基，X代表氧原子或硫原子，且W係未經取代之胺基或可經一或兩個以下相似或不同基團取代之胺基：C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-環烷基、氰基、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基胺基、二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基)胺基、羥基、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基或C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-環烷氧基，其中不包含：

- 2-(2-氯苳基)-2-(羥基亞胺基)-N-甲基乙醯胺，
- 2-(羥基亞胺基)-2-(2-羥基苳基)-N-甲基乙醯胺，
- 2-(羥基亞胺基)-2-(2-碘苳基)-N,N-二甲基乙醯胺，
- 2-(羥基亞胺基)-2-(4-甲氧基苳基)-N-甲基乙醯胺，
- 2-(羥基亞胺基)-2-[2-(羥甲基)苳基]-N-甲基乙醯胺，
- 2-(羥基亞胺基)-2-苳基-N-丙基乙醯胺，
- 2-(羥基亞胺基)-N,N-二甲基-2-(2-苳氧基苳基)乙醯胺，
- 2-(羥基亞胺基)-N,N-二甲基-2-苳基乙醯胺，
- 2-(羥基亞胺基)-N-異丙基-2-(4-甲氧基苳基)乙醯胺，
- 2-(羥基亞胺基)-N-異丙基-2-苳基乙醯胺，

2-(羥基亞胺基)-N-甲基-2-(2-甲基苯基)乙醯胺，  
 2-(羥基亞胺基)-N-甲基-2-(2-苯氧基苯基)乙醯胺，  
 2-(羥基亞胺基)-N-甲基-2-(4-甲基苯基)乙醯胺，  
 2-(羥基亞胺基)-N-甲基-2-[2-(4-甲基苯氧基)苯基]乙醯  
 胺，  
 2-(羥基亞胺基)-N-甲基-2-苯基乙醯胺，  
 N,N-二乙基-2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯胺，  
 N-烯丙基-2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯胺，  
 N-烯丙基-2-(羥基亞胺基)-N-甲基-2-苯基乙醯胺，  
 N-丁基-2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯胺，  
 N-乙基-2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯胺，  
 N-庚基-2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯胺，  
 N-第三-丁基-2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯胺，  
 1-(氮雜環庚烷-1-基)-2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯，  
 2-(羥基亞胺基)-2-苯基-1-(3-苯基吡咯啉-1-基)乙醯，  
 2-(羥基亞胺基)-1-(嗎啉-4-基)-2-苯基乙醯，  
 2-(羥基亞胺基)-2-苯基-1-(六氫吡啶-1-基)乙醯，  
 1-(2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯基)-L-脯胺酸甲酯，  
 N-環己基-2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯胺，  
 2-(羥基亞胺基)-N-(嗎啉-4-基)-2-苯基乙醯胺，  
 2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯肼，  
 2-(4-氯苯基)-2-(羥基亞胺基)乙硫醯胺，  
 2-(2,6-二氯苯基)-2-(羥基亞胺基)乙硫醯胺，  
 N-羥基-2-(羥基亞胺基)-2-(4-甲基苯基)乙醯胺，

N-羥基-2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯胺，

2-(2-乙醯胺基苯基)-N-羥基-2-(羥基亞胺基)乙醯胺。

在另一態樣中，本發明亦係關於包括有效及非植物毒性量之式(I)活性化合物的殺真菌劑組合物。

表達「有效及非植物毒性量」意指足以控制或破壞存在或易於出現於作物中之真菌且不會出現關於該等作物之任一可察覺植物毒性症狀的本發明組合物量。此用量端視擬控制之真菌、作物類型、氣候條件及本發明殺真菌劑組合物中所包含之化合物而定，可在寬範圍內變化。該用量可藉由系統田間試驗確定，此在熟習此項技術者之能力範圍內。

因此，本發明提供一種包括有效量之如本文所定義式(I)化合物(作為活性成份)及農業上可接受之載體、載劑或填充劑之殺真菌劑組合物。

根據本發明，術語「載體」表示與式(I)活性化合物相組合或聯合以使其更易於施加(尤其)至植株部分的天然或合成有機或無機化合物。因此，該載體通常係惰性載體且應為農業上可接受。該載體可為固體或液體。適宜載體之實例包含黏土、天然或合成矽酸鹽、二氧化矽、樹脂、蠟、固體肥料、水、醇(尤其丁醇)、有機溶劑、礦物油及植物油及其衍生物。亦可使用該等載體之混合物。

本發明組合物亦可包括額外組份。特定而言，該組合物可進一步包括表面活性劑。表面活性劑可為離子型或非離子型乳化劑、分散劑或潤濕劑或該等表面活性劑之混合

物。可提及(例如)聚丙烯酸鹽、木素磺酸鹽、酚磺酸鹽或萘磺酸鹽、環氧乙烷與脂肪醇或與脂肪酸或與脂肪胺之縮聚物、經取代酚(尤其烷基酚或芳基酚)、磺基琥珀酸酯之鹽、牛磺酸衍生物(尤其牛磺酸烷基酯)、聚氧乙基化醇或酚之磷酸酯、多元醇之脂肪酸酯及含有硫酸根、磺酸根及磷酸根官能團之上述化合物的衍生物。通常，若活性化合物及/或惰性載體係水不溶性且所應用之媒劑係水時，則必需存在至少一種表面活性劑。較佳地，表面活性劑含量可佔該組合物之5重量%至40重量%。

視需要，亦可包含額外組份，例如保護性膠體、黏著劑、增稠劑、觸變劑、滲透劑、穩定劑、螯合劑。更通常而言，可將活性化合物與符合一般調配技術之任何固體或液體添加劑進行組合。

通常，本發明組合物可含有0.05重量%至99重量%之活性化合物，較佳為10重量%至70重量%。

本發明組合物可以各種形式使用，例如氣溶膠分配劑、膠囊懸浮液、冷霧化濃縮物、可撒施之粉劑、可乳化之濃縮物、水包油乳液、油包水乳液、經囊封顆粒、精細顆粒、種子處理用水懸劑(flowable concentrate for seed treatment)、氣體(在一定壓力下)、產生產物之氣體、顆粒、熱霧化濃縮物、大顆粒、微顆粒、油分散性粉劑、油懸劑(oil miscible flowable concentrate)、油混溶性液體、膏糊、植物桿、乾燥種子處理用粉劑、塗覆有農藥之種子、可溶性濃縮物、可溶性粉劑、種子處理用溶液、懸浮

濃縮物(可流動濃縮物)、超低容量(ULV)液體、超低容量(ULV)懸浮液、水分散性顆粒或錠劑、漿液處理用水分散性粉劑、水溶性顆粒或錠劑、種子處理用水溶性粉劑及可潤濕性粉劑。該等組合物不僅包含藉助諸如噴霧或撒施器件等適宜器件準備施加於擬處理之植物或種子的組合物，且亦包含在將其施加於作物之前必須進行稀釋之經濃縮的市售組合物。

本發明化合物亦可與一或多種殺昆蟲劑、殺真菌劑、殺細菌劑、引誘劑、殺蟎藥或外激素活性物質或具有生物活性之其他化合物混合。由此獲得之混合物具有寬範圍之活性。與其他殺真菌劑化合物之混合物尤其有利。包括式(I)化合物與殺細菌劑化合物之混合物的本發明組合物亦可尤其有利。

適宜殺真菌劑混合搭配劑之實例可選自以下列表：

(1) 麥角固醇生物合成之抑制劑，例如(1.1) 阿迪莫夫(aldimorph) (1704-28-5)、(1.2) 阿紮康唑(azaconazole) (60207-31-0)、(1.3) 聯苯三唑醇(bitertanol) (55179-31-2)、(1.4) 糠菌唑(bromuconazole) (116255-48-2)、(1.5) 環丙唑醇(cyproconazole) (113096-99-4)、(1.6) 苜氣三唑醇(diclobutrazole) (75736-33-3)、(1.7) 苯醚甲環唑(difenoconazole) (119446-68-3)、(1.8) 烯唑醇(diniconazole) (83657-24-3)、(1.9) 烯唑醇-M (83657-18-5)、(1.10) 十二環嗎啉(dodemorph) (1593-77-7)、(1.11) 乙酸十二環嗎啉(31717-87-0)、(1.12) 環氧康唑(epoxiconazole) (106325-

08-0)、(1.13) 乙環唑(etaconazole) (60207-93-4)、(1.14) 氟苯嘧啶醇(fenarimol) (60168-88-9)、(1.15) 分菌氟唑(fenbuconazole) (114369-43-6)、(1.16) 芬黑沙米(fenhexamid) (126833-17-8)、(1.17) 苯鏽啉(fenpropidin) (67306-00-7)、(1.18) 丁苯嗎啉(fenpropimorph) (67306-03-0)、(1.19) 氟喹唑(fluquinconazole) (136426-54-5)、(1.20) 呋啞醇(flurprimidol) (56425-91-3)、(1.21) 氟矽唑(flusilazole) (85509-19-9)、(1.22) 粉唑醇(flutriafol) (76674-21-0)、(1.23) 呋菌唑(furconazole) (112839-33-5)、(1.24) 呋醚唑(furconazole-cis) (112839-32-4)、(1.25) 己唑醇(hexaconazole) (79983-71-4)、(1.26) 伊米薩利(imazalil) (60534-80-7)、(1.27) 硫酸伊米薩利(58594-72-2)、(1.28) 亞胺唑(imibenconazole) (86598-92-7)、(1.29) 種菌唑(ipconazole) (125225-28-7)、(1.30) 葉菌唑(metconazole) (125116-23-6)、(1.31) 滅克落(myclobutanil) (88671-89-0)、(1.32) 萘替芬(naftifine) (65472-88-0)、(1.33) 氟苯嘧啶醇(nuarimol) (63284-71-9)、(1.34) 噁咪唑(oxpoconazole) (174212-12-5)、(1.35) 多效唑(paclobutrazol) (76738-62-0)、(1.36) 稻瘟酯(pefurazoate) (101903-30-4)、(1.37) 配那唑(penconazole) (66246-88-6)、(1.38) 粉病靈(piperalin) (3478-94-2)、(1.39) 丙氯靈(prochloraz) (67747-09-5)、(1.40) 丙環唑(propiconazole) (60207-90-1)、(1.41) 普硫康唑(prothioconazole) (178928-70-6)、(1.42) 稗草丹(pyributicarb) (88678-67-5)、(1.43) 消斑肱(pyrifenoxy)

(88283-41-4)、(1.44) 昆可那唑(quinconazole) (103970-75-8)、(1.45) 矽氟唑(simeconazole) (149508-90-7)、(1.46) 螺噁胺(spiroxamine) (118134-30-8)、(1.47) 戊唑醇(tebuconazole) (107534-96-3)、(1.48) 特比萘芬(terbinafine) (91161-71-6)、(1.49) 氟醚唑(tetraconazole) (112281-77-3)、(1.50) 三唑酮(triadimefon) (43121-43-3)、(1.51) 三唑醇(triadimenol) (89482-17-7)、(1.52) 克啉菌(tridemorph) (81412-43-3)、(1.53) 粉鏽胺(triflumizole) (68694-11-1)、(1.54) 噤胺靈(triforine) (26644-46-2)、(1.55) 滅菌唑(triticonazole) (131983-72-7)、(1.56) 烯效唑(uniconazole) (83657-22-1)、(1.57) 單克素(uniconazole-p) (83657-17-4)、(1.58) 維尼康唑(viniconazole) (77174-66-4)、(1.59) 伏立康唑(voriconazole) (137234-62-9)、(1.60) 1-(4-氯苯基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)環庚醇(129586-32-9)、(1.61) 1-(2,2-二甲基-2,3-二氫-1H-節-1-基)-1H-咪唑-5-甲酸甲酯(110323-95-0)、(1.62) N'-{5-(二氟甲基)-2-甲基-4-[3-(三甲基矽烷基)丙氧基]苯基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲醯胺、(1.63) N-乙基-N-甲基-N'-{2-甲基-5-(三氟甲基)-4-[3-(三甲基矽烷基)丙氧基]苯基}亞胺基甲醯胺及(1.64) 1H-咪唑-1-硫代甲酸O-[1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁-2-基]酯(111226-71-2)。

(2) 呼吸鏈複合物I或II之抑制劑，例如(2.1) 必殺酚(bixafen) (581809-46-3)、(2.2) 波斯卡利(boscalid) (188425-85-6)、(2.3) 萎鏽靈(carboxin) (5234-68-4)、(2.4)

二氟林 (diflumetorim) (130339-07-0)、(2.5) 甲呋醯胺 (fenfuram) (24691-80-3)、(2.6) 氟吡菌醯胺 (fluopyram) (658066-35-4)、(2.7) 氟醯胺 (flutolanil) (66332-96-5)、(2.8) 福沙若德 (fluxapyroxad) (907204-31-3)、(2.9) 福拉比 (furametpyr) (123572-88-3)、(2.10) 茂谷樂 (furmecyclox) (60568-05-0)、(2.11) 異吡唑醯胺 (isopyrazam)(順-差向外消旋物 1RS,4SR,9RS 及反-差向外消旋物 1RS,4SR,9SR 之混合物)(881685-58-1)、(2.12) 異吡唑醯胺(反-差向外消旋物 1RS,4SR,9SR)、(2.13) 異吡唑醯胺(反-差向對映異構體 1R,4S,9S)、(2.14) 異吡唑醯胺(反-差向對映異構體 1S,4R,9R)、(2.15) 異吡唑醯胺(順-差向外消旋物 1RS,4SR,9RS)、(2.16) 異吡唑醯胺(順-差向對映異構體 1R,4S,9R)、(2.17) 異吡唑醯胺(順-差向對映異構體 1S,4R,9S)、(2.18) 滅鏽胺 (mepronil) (55814-41-0)、(2.19) 氧化萎鏽靈 (oxycarboxin) (5259-88-1)、(2.20) 噴氟芬 (penflufen) (494793-67-8)、(2.21) 吡噻菌胺 (penthioopyrad) (183675-82-3)、(2.22) 西達山 (sedaxane) (874967-67-6)、(2.23) 噻氟菌胺 (thifluzamide) (130000-40-7)、(2.24) 1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.25) 3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[2-(1,1,2,2-四氟乙氧基)苯基]-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.26) 3-(二氟甲基)-N-[4-氟-2-(1,1,2,3,3,3-六氟丙氧基)苯基]-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺、(2.27) N-[1-(2,4-二氟苯基)-1-甲氧基丙烷-2-基]-3-(二氟甲基)-1-甲基-1H-吡唑-4-甲醯胺 (1092400-95-7)



(WO 2008148570)及其鹽。

(3) 吸鏈複合物 III 之抑制劑，例如 (3.1) 麥特卓丁 (ametoctradin) (865318-97-4)、(3.2) 吡唑磺菌胺 (amisulbrom) (348635-87-0)、(3.3) 腈嘧菌酯 (azoxystrobin) (131860-33-8)、(3.4) 賽唑法米 (cyazofamid) (120116-88-3)、(3.5) 二莫西史卓賓 (dimoxystrobin) (141600-52-4)、(3.6) 烯脞史卓賓 (enestroburin) (238410-11-2) (WO 2004/058723)、(3.7) 泛噁同 (famoxadone) (131807-57-3) (WO 2004/058723)、(3.8) 芬納米同 (fenamidone) (161326-34-7) (WO 2004/058723)、(3.9) 氟呋史卓賓 (fluoxastrobin) (361377-29-9) (WO 2004/058723)、(3.10) 苯氧菊酯 (kresoxim-methyl) (143390-89-0) (WO 2004/058723)、(3.11) 麥脫明諾史卓賓 (metominostrobin) (133408-50-1) (WO 2004/058723)、(3.12) 歐沙史卓賓 (orysastrobin) (189892-69-1) (WO 2004/058723)、(3.13) 比可西史卓賓 (picoxystrobin) (117428-22-5) (WO 2004/058723)、(3.14) 派拉克史卓賓 (pyraclostrobin) (175013-18-0) (WO 2004/058723)、(3.15) 派拉麥特史卓賓 (pyrametostrobin) (915410-70-7) (WO 2004/058723)、(3.16) 唑菌酯 (pyraoxystrobin) (862588-11-2) (WO 2004/058723)、(3.17) 吡利本克 (pyribencarb) (799247-52-2) (WO 2004/058723)、(3.18) 布洛芬 (trifloxystrobin) (141517-21-7) (WO 2004/058723)、(3.19) (2E)-2-(2-{[6-(3-氯-2-甲基苯氧基)-5-氟嘧啶-4-基]氧基}苯基)-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基乙醯胺 (WO 2004/058723)、

(3.20) (2E)-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基-2-(2-{{{(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亞乙基}胺基)氧基}甲基}苯基)乙醯胺(WO 2004/058723)及其鹽、(3.21) (2E)-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基-2-{2-[(E)-({1-[3-(三氟甲基)苯基]乙氧基}亞胺基)甲基]苯基}乙醯胺(158169-73-4)、(3.22) (2E)-2-{2-[[{(1E)-1-(3-{{(E)-1-氟-2-苯基乙烯基}氧基}苯基)亞乙基]胺基}氧基]甲基]苯基}-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基乙醯胺(326896-28-0)、(3.23) (2E)-2-{2-[[{(2E,3E)-4-(2,6-二氟苯基)丁-3-烯-2-亞基]胺基}氧基]甲基]苯基}-2-(甲氧基亞胺基)-N-甲基乙醯胺、(3.24) 2-氟-N-(1,1,3-三甲基-2,3-二氫-1H-茛-4-基)吡啶-3-甲醯胺(119899-14-8)、(3.25) 5-甲氧基-2-甲基-4-(2-[[{(1E)-1-[3-(三氟甲基)苯基]亞乙基}胺基)氧基]甲基]苯基)-2,4-二氫-3H-1,2,4-三唑-3-酮、(3.26) (2E)-2-{2-[[{環丙基[(4-甲氧基苯基)亞胺基]甲基}硫基]甲基]苯基}-3-甲氧基丙-2-烯酸甲酯(149601-03-6)、(3.27) N-(3-乙基-3,5,5-三甲基環己基)-3-(甲醯基胺基)-2-羥基苯甲醯胺(226551-21-9)、(3.28) 2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙醯胺(173662-97-0)、(3.29) (2R)-2-{2-[(2,5-二甲基苯氧基)甲基]苯基}-2-甲氧基-N-甲基乙醯胺(394657-24-0)及其鹽。

(4) 有絲分裂及細胞分裂之抑制劑，例如(4.1) 苯菌靈(benomyl) (17804-35-2)、(4.2) 多菌靈(carbendazim) (10605-21-7)、(4.3) 氯苯基苯并咪唑(chlorfenazole) (3574-96-7)、(4.4) 乙徵威(diethofencarb) (87130-20-9)、

(4.5) 衣沙布山(ethaboxam) (162650-77-3)、(4.6) 氟吡菌胺(fluopicolide) (239110-15-7)、(4.7) 麥穗寧(fuberidazole) (3878-19-1)、(4.8) 紋枯脲(pencycuron) (66063-05-6)、(4.9) 噻苯噻唑(thiabendazole) (148-79-8)、(4.10) 甲基硫芬酯(thiophanate-methy) (23564-05-8)、(4.11) 硫芬酯(thiophanate) (23564-06-9)、(4.12) 唑沙麥(zoxamide) (156052-68-5)、(4.13) 5-氯-7-(4-甲基六氫吡啶-1-基)-6-(2,4,6-三氟苯基)[1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶(214706-53-3)、(4.14) 3-氯-5-(6-氯吡啶-3-基)-6-甲基-4-(2,4,6-三氟苯基)噻嗪(1002756-87-7)及其鹽。

(5) 能夠具有多位點作用之化合物，例如(5.1) 波爾多液混合物(bordeaux mixture) (8011-63-0)、(5.2) 敵菌丹(captafol) (2425-06-1)、(5.3) 克菌丹(captan) (133-06-2) (WO 02/12172)、(5.4) 百菌清(chlorothalonil) (1897-45-6)、(5.5) 氫氧化銅(20427-59-2)、(5.6) 環烷酸銅(1338-02-9)、(5.7) 氧化銅(1317-39-1)、(5.8) 氧氯化銅(1332-40-7)、(5.9) 硫酸銅(2+) (7758-98-7)、(5.10) 苯氯磺胺(dichlofluanid) (1085-98-9)、(5.11) 二氯蔥醌(dithianon) (3347-22-6)、(5.12) 多果定(dodine) (2439-10-3)、(5.13) 多果定游離鹼、(5.14) 福美鐵(ferbam) (14484-64-1)、(5.15) 氟滅菌丹(fluorofolpet) (719-96-0)、(5.16) 滅菌丹(folpet) (133-07-3)、(5.17) 雙胍辛胺(guazatine) (108173-90-6)、(5.18) 乙酸雙胍辛胺、(5.19) 亞胺歐它丁(iminoctadine) (13516-27-3)、(5.20) 苯磺酸亞胺歐它丁

(169202-06-6)、(5.21) 三乙酸亞胺歐它丁(57520-17-9)、(5.22) 代森錳銅(mancopper) (53988-93-5)、(5.23) 代森錳鋅(mancozeb) (8018-01-7)、(5.24) 代森錳(maneb) (12427-38-2)、(5.25) 代森聯(metiram) (9006-42-2)、(5.26) 代森聯鋅(9006-42-2)、(5.27) 喹啉銅(oxine-copper) (10380-28-6)、(5.28) 普羅帕脒(propamidine) (104-32-5)、(5.29) 丙森鋅(propineb) (12071-83-9)、(5.30) 硫及硫製劑(包含多硫化鈣)(7704-34-9)、(5.31) 塞蘭姆(thiram) (137-26-8)、(5.32) 對甲抑菌靈(tolylfluanid) (731-27-1)、(5.33) 乙硫鋅(zineb) (12122-67-7)、(5.34) 福美鋅(ziram) (137-30-4) 及其鹽。

(6) 能夠誘導宿主防禦之化合物，例如(6.1) S-甲基阿西本唑(acibenzolar-S-methyl) (135158-54-2)、(6.2) 異噻尼(isotianil) (224049-04-1)、(6.3) 撲殺熱(probenazole) (27605-76-1)、(6.4) 替丁尼(tiadinil) (223580-51-6)及其鹽。

(7) 胺基酸及/或蛋白質生物合成之抑制劑，例如(7.1) 胺撲滅(andoprim) (23951-85-1)、(7.2) 殺稻瘟菌素-S(blasticidin-S) (2079-00-7)、(7.3) 西波定(cyprodinil) (121552-61-2)、(7.4) 春日黴素(kasugamycin) (6980-18-3)、(7.5) 鹽酸水合春雷黴素(19408-46-9)、(7.6) 嘧菌胺(mepanipyrim) (110235-47-7)、(7.7) 二甲嘧菌胺(pyrimethanil) (53112-28-0)及其鹽。

(8) ATP 產生抑制劑，例如(8.1) 乙酸三苯錫(fentin

acetate) (900-95-8)、(8.2) 三苯基氯化錫(fentin chloride) (639-58-7)、(8.3) 氫氧三苯錫(fentin hydroxide) (76-87-9) 及(8.4) 矽硫芬(silthiofam) (175217-20-6)。

(9) 細胞壁合成抑制劑，例如(9.1) 本賽夫利卡(benthiavalicarb) (177406-68-7)、(9.2) 烯醯嗎啉(dimethomorph) (110488-70-5)、(9.3) 氟馬夫(flumorph) (211867-47-9)、(9.4) 衣普法利卡(iprovalicarb) (140923-17-7)、(9.5) 雙炔醯菌胺(mandipropamid) (374726-62-2)、(9.6) 多氧黴素(polyoxin) (11113-80-7)、(9.7) 保粒黴素(polyoxorim) (22976-86-9)、(9.8) 有效黴素A(validamycin A) (37248-47-8)及(9.9) 瓦利芬酯(valifenalate) (283159-94-4;283159-90-0)。

(10) 脂質及膜合成之抑制劑，例如(10.1) 聯苯(92-52-4)、(10.2) 氯苯甲醚(chloroneb) (2675-77-6)、(10.3) 氯硝胺(dicloran) (99-30-9)、(10.4) 敵瘟磷(edifenphos) (17109-49-8)、(10.5) 土菌靈(etridiazole) (2593-15-9)、(10.6) 引多克(iodocarb) (55406-53-6)、(10.7) 異稻瘟淨(iprobenfos) (26087-47-8)、(10.8) 稻瘟靈(isoprothiolane) (50512-35-1)、(10.9) 霜黴威(propamocarb) (25606-41-1)、(10.10) 鹽酸霜黴威(25606-41-1)、(10.11) 硫菌威(prothiocarb) (19622-08-3)、(10.12) 定菌磷(pyrazophos) (13457-18-6)、(10.13) 五氯硝苯(quintozene) (82-68-8)、(10.14) 四氯硝基苯(tecnazene) (117-18-0)及(10.15) 甲基立枯磷(tolclofos-methyl) (57018-04-9)。

(11) 黑素生物合成之抑制劑，例如(11.1) 卡波帕麥 (carpropamid) (104030-54-8)、(11.2) 大克賽美(dicloctymet) (139920-32-4)、(11.3) 芬呋尼(fenoxanil) (115852-48-7)、(11.4) 四氯苯酞(phthalide) (27355-22-2)、(11.5) 咯嗪酮(pyroquilon) (57369-32-1)及(11.6) 三環唑(tricyclazole) (41814-78-2)。

(12) 核酸合成之抑制劑，例如(12.1) 苯霜靈(benalaxyl) (71626-11-4)、(12.2) 苯霜靈-M(凱瑞拉斯(kiralaxyl)) (98243-83-5)、(12.3) 磺嘧菌靈(bupirimate) (41483-43-6)、(12.4) 克勞拉康(clozylacon) (67932-85-8)、(12.5) 二甲嘧酚(dimethirimol) (5221-53-4)、(12.6) 乙菌定(ethirimol) (23947-60-6)、(12.7) 呋霜靈(furalaxyl) (57646-30-7)、(12.8) 惡黴靈(hymexazol) (10004-44-1)、(12.9) 甲霜靈(metalaxyl) (57837-19-1)、(12.10) 甲霜靈-M(高效甲霜靈(mefenoxam))(70630-17-0)、(12.11) 甲呋醯胺(ofurace) (58810-48-3)、(12.12) 惡霜靈(oxadixyl) (77732-09-3)及(12.13) 奧索利酸(oxolinic acid) (14698-29-4)。

(13) 信號轉導抑制劑，例如(13.1) 乙菌利(chlozolate) (84332-86-5)、(13.2) 拌種咯(fenpiclonil) (74738-17-3)、(13.3) 咯菌腈(fludioxonil) (131341-86-1)、(13.4) 異菌脲(iprodione) (36734-19-7)、(13.5) 腐黴利(procymidone) (32809-16-8)、(13.6) 奎諾克西芬(quinoxifen) (124495-18-7)及(13.7) 伐菌唑靈(vinclozolin) (50471-44-8)。

(14) 能夠用作解聯劑之化合物，例如(14.1) 雙苯唑菌

醇(binapacryl) (485-31-4)、(14.2) 消螨普(dinocap) (131-72-6)、(14.3) 噻菌脞(ferimzone) (89269-64-7)、(14.4) 氟啶胺(fluzinam) (79622-59-6) 及 (14.5) 敵螨普(meptyldinocap) (131-72-6)。

(15) 其他化合物，例如 (15.1) 苯噻清(benthiazole) (21564-17-0)、(15.2) 苯噻噁嗪(bethoxazin) (163269-30-5)、(15.3) 卡巴西黴素(capsimycin) (70694-08-5)、(15.4) 香芹酮(carvone) (99-49-0)、(15.5) 滅蟎猛(chinomethionat) (2439-01-2)、(15.6) 克拉雜芬(chlazafenone) (688046-61-9)、(15.7) 銅合浦單劑(cufraneb) (11096-18-7)、(15.8) 賽扶芬納米(cyflufenamid) (180409-60-3)、(15.9) 霜脲氟(cymoxanil) (57966-95-7)、(15.10) 解草磺醯胺(cyprosulfamide) (221667-31-8)、(15.11) 棉隆(dazomet) (533-74-4)、(15.12) 咪菌威(debacarb) (62732-91-6)、(15.13) 雙氯酚(dichlorophen) (97-23-4)、(15.14) 噻菌清(diclomezine) (62865-36-5)、(15.15) 燕麥枯(difenzoquat) (49866-87-7)、(15.16) 甲基硫酸燕麥枯(43222-48-6)、(15.17) 二苯胺(diphenylamine) (122-39-4)、(15.18) 安費諾(ecomate)、(15.19) 芬普紫米(fenpyrazamine) (473798-59-3)、(15.20) 氟米脫弗(flumetover) (154025-04-4)、(15.21) 氟氣菌核利(fluoroimide) (41205-21-4)、(15.22) 磺菌胺(flusulfamide) (106917-52-6)、(15.23) 福魯替尼(flutianil) (304900-25-2)、(15.24) 三乙膦酸鋁(fosetyl-aluminium) (39148-24-8)、(15.25) 三乙膦酸鈣(fosetyl-calcium)、

(15.26) 三乙膦酸鈉 (fosetyl-sodium) (39148-16-8)、  
(15.27) 六氯苯(118-74-1)、(15.28) 伊馬美新(irumamycin)  
(81604-73-1)、(15.29) 磺菌威(methasulfocarb) (66952-49-  
6)、(15.30) 異硫氰酸甲酯(556-61-6)、(15.31) 美查芬隆  
(metrafenone) (220899-03-6)、(15.32) 滅粉黴素(mildiomycin)  
(67527-71-3)、(15.33) 納他黴素(natamycin) (7681-93-  
8)、(15.34) 二甲基二硫代胺基甲酸鎳(15521-65-0)、  
(15.35) 酞菌酯(nitrothal-isopropyl) (10552-74-6)、(15.36)  
辛噻酮(octhilinone) (26530-20-1)、(15.37) 惡莫克  
(oxamocarb) (917242-12-7)、(15.38) 氧芬新(oxyfenthiin)  
(34407-87-9)、(15.39) 五氯苯酚及鹽(87-86-5)、(15.40)  
苯氧司林(phenothrin)、(15.41) 亞磷酸及其鹽(13598-36-  
2)、(15.42) 普潘莫卡三乙膦酸鹽(propamocarb-  
fosetilate)、(15.43) 丙諾新鈉鹽(propanosine-sodium)  
(88498-02-6)、(15.44) 普奎那茲(proquinazid) (189278-12-  
4)、(15.45) 吡咯尼群(pyrrolnitrine) (1018-71-9) (EP-A 1 559  
320)、(15.46) 特布氟喹(tebufloquin) (376645-78-2)、  
(15.47) 酞枯酸(tecloftalam) (76280-91-6)、(15.48) 特尼  
伐尼(tolnifanide) (304911-98-6)、(15.49) 咪唑嗪(triazoxide)  
(72459-58-6)、(15.50) 水楊菌胺(trichlamide) (70193-21-  
4)、(15.51) 氰菌胺(zarilamid) (84527-51-5)、(15.52) 1-  
(4-{4-[(5R)-5-(2,6-二氯苯基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-  
噻唑-2-基}六氫吡啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡  
唑-1-基]乙酮(1003319-79-6) (WO 2008013622)、(15.53) 1-



(4-{4-[(5S)-5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}六氫吡啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮(1003319-80-9) (WO 2008013622)、(15.54) 1-(4-{4-[5-(2,6-二氟苯基)-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}六氫吡啶-1-基)-2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]乙酮(1003318-67-9) (WO 2008013622)、(15.55) 1H-咪唑-1-甲酸 1-(4-甲氧基苯氧基)-3,3-二甲基丁-2-基酯(111227-17-9)、(15.56) 2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺醯基)吡啶(13108-52-6)、(15.57) 2,3-二丁基-6-氯噻吩并[2,3-d]嘧啶-4(3H)-酮(221451-58-7)、(15.58) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5R)-5-苯基-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}六氫吡啶-1-基)乙酮(1003316-53-7) (WO 2008013622)、(15.59) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-(4-{4-[(5S)-5-苯基-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基]-1,3-噻唑-2-基}六氫吡啶-1-基)乙酮(1003316-54-8) (WO 2008013622)、(15.60) 2-[5-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-1-基]-1-{4-[4-(5-苯基-4,5-二氫-1,2-噁唑-3-基)-1,3-噻唑-2-基]六氫吡啶-1-基}乙酮(1003316-51-5) (WO 2008013622)、(15.61) 2-丁氧基-6-碘-3-丙基-4H-吡啶-4-酮、(15.62) 2-氯-5-[2-氯-1-(2,6-二氟-4-甲氧基苯基)-4-甲基-1H-咪唑-5-基]吡啶、(15.63) 2-苯基苯酚及鹽(90-43-7)、(15.64) 3,4,5-三氯吡啶-2,6-二甲腈(17824-85-0)、(15.65) 3-[5-(4-氯苯基)-2,3-二甲基-1,2-噁唑啉-3-基]吡啶、(15.66) 3-氯-5-(4-氯苯基)-4-(2,6-二氟苯基)-6-甲基噻嗪、(15.67) 4-(4-

氣苄基)-5-(2,6-二氣苄基)-3,6-二甲基噻嗪、(15.68) 5-胺  
 基-1,3,4-噻二唑-2-硫醇、(15.69) 5-氣-N'-苄基-N'-(丙-2-  
 炔-1-基)噻吩-2-磺醯肼(134-31-6)、(15.70) 5-甲基-6-辛基  
 [1,2,4]三唑并[1,5-a]嘧啶-7-胺、(15.71) (2Z)-3-胺基-2-氣  
 基-3-苄基丙-2-烯酸乙酯、(15.72) N-(4-氣苄基)-3-[3-甲氧  
 基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苄基]丙醯胺、(15.73) N-[(4-氣苄  
 基)(氣基)甲基]-3-[3-甲氧基-4-(丙-2-炔-1-基氧基)苄基]丙  
 醯胺、(15.74) N-[(5-溴-3-氣吡啶-2-基)甲基]-2,4-二氣吡  
 啶-3-甲醯胺、(15.75) N-[1-(5-溴-3-氣吡啶-2-基)乙基]-  
 2,4-二氣吡啶-3-甲醯胺、(15.76) N-[1-(5-溴-3-氣吡啶-2-  
 基)乙基]-2-氣-4-碘吡啶-3-甲醯胺、(15.77) N-{(E)-[(環丙  
 基甲氧基)亞胺基][6-(二氣甲氧基)-2,3-二氣苄基]甲基}-2-  
 苄基乙醯胺(221201-92-9)、(15.78) N-{(Z)-[(環丙基甲氧  
 基)亞胺基][6-(二氣甲氧基)-2,3-二氣苄基]甲基}-2-苄基乙  
 醯胺(221201-92-9)、(15.79) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氣  
 甲基)-1H-吡唑-1-基]乙醯基}六氫吡啶-4-基)-N-(1,2,3,4-四  
 氫茶-1-基)-1,3-噻唑-4-甲醯胺(922514-49-6) (WO  
 2007014290)、(15.80) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氣甲基)-  
 1H-吡唑-1-基]乙醯基}六氫吡啶-4-基)-N-[(1R)-1,2,3,4-四  
 氫茶-1-基]-1,3-噻唑-4-甲醯胺(922514-07-6) (WO  
 2007014290)、(15.81) N-甲基-2-(1-{[5-甲基-3-(三氣甲基)-  
 1H-吡唑-1-基]乙醯基}六氫吡啶-4-基)-N-[(1S)-1,2,3,4-四  
 氫茶-1-基]-1,3-噻唑-4-甲醯胺(922514-48-5) (WO  
 2007014290)、(15.82) {6-[[[(1-甲基-1H-四唑-5-基)(苄基)

甲亞基]胺基}氧基)甲基]吡啶-2-基}胺基甲酸戊基酯、  
 (15.83) 吩嗪-1-甲酸、(15.84) 喹啉-8-醇(134-31-6)及  
 (15.85) 喹啉-8-醇硫酸酯(2:1)(134-31-6)。

根據本發明之另一目標，提供控制植物、作物或種子之植物致病真菌之方法，該方法之特徵在於將農藝學有效且實質上非植物毒性量之本發明殺真菌劑組合物經由種子處理、葉部施加、莖部施加、浸透或滴注施加(化學灌溉)方式施加至以下部分：種子、植物或植物果實或已種植植物或希望種植植物之土壤或惰性基質(例如無機基質，例如砂、石棉、玻璃棉；膨脹礦物質，例如珍珠岩、蛭石、沸石或膨脹黏土)、浮石粉、火成碎屑物或漿料、合成有機基質(例如聚胺基甲酸酯)、有機基質(例如泥炭、堆肥、樹廢產物(例如椰子殼纖維、木質纖維或木片、樹皮))或液體基質(例如浮根式水耕系統、營養液膜技術、氣耕栽培)。

表達「施加至欲處理之植物」應理解為意指出於本發明目的，可藉助諸如以下各種處理方法來施加作為本發明標的物之殺真菌劑組合物：

- 向該等植物之地上部分噴塗包括該等組合物中之一者的液體，
- 在該等植物周圍撒施、向土壤中納入顆粒或粉末、噴霧及(在樹之情形下)噴射或塗抹，
- 藉助包括該等組合物中之一者之植物保護性混合物來塗覆或膜塗覆該等植物之種子。

本發明方法可為治癒、預防或根除方法。在此方法中，

所用組合物可預先藉由混合兩種或更多種本發明之活性化合物製得。

根據此一方法之替代方式，亦可同時、連續或分開單獨施加化合物(A)及(B)以產生各含有兩種或三種活性成份(A)或(B)中之一者之不同組合物的聯合(A)/(B)效應。

本發明處理方法中經常施加之活性化合物的劑量通常且較佳係如下：

- 對於葉部處理：0.1 g/ha至10,000 g/ha、較佳10 g/ha至1,000 g/ha、更佳50 g/ha至300g/ha；在浸透或滴注施加之情形下，劑量甚至可有所減小，尤其在使用惰性基質(例如石棉或珍珠岩)時，
- 對於種子處理：2 g至200 g/100公斤種子、較佳3 g至150 g/100公斤種子；
- 對於土壤處理：0.1 g/ha至10,000 g/ha、較佳1 g/ha至5,000 g/ha。

本文所示之劑量係呈現為本發明方法之闡釋性實例。熟習此項技術者將知曉如何(尤其)根據擬處理之植物或作物之性質來修改施加劑量。

在具體條件下，舉例而言，根據欲處理或控制之植物致病真菌的性質，較低劑量即可提供適當保護。某些氣候條件、抗性或其他因素(例如植物致病真菌之性質或(例如)具有該等真菌之植物的感染程度)可需要較高劑量之組合活性成份。最佳劑量經常取決於若干因素，例如預處理之植物致病真菌的類型、受感染植物之類型或發育程度、植被

密度或施加方法。

不加以限制，使用本發明之農藥組合物或組合處理之作物係(例如)葡萄藤，但此可為穀物、蔬菜、紫花苜蓿、大豆、市售果園作物、草皮、木頭、樹或園藝植物。

本發明處理方法亦可用於處理諸如塊莖或根莖等繁殖材料、以及種子、幼苗或幼苗移植物及植物或植物移植物。該處理方法亦可用於處理根。本發明處理方法亦可用於處理諸如有關植物之樹幹、莖或梗、葉、花及果實等植物之地上部分。

在可藉由本發明方法保護之植物中，可提及棉花；亞麻；葡萄樹；水果或蔬菜作物，例如薔薇科(Rosaceae sp.)(例如諸如蘋果及梨等仁果，以及諸如杏、杏仁及桃子等核果)、茶藨子科(Ribesioideae sp.)、胡桃科(Juglandaceae sp.)、樺木科(Betulaceae sp.)、漆樹科(Anacardiaceae sp.)、殼鬥科(Fagaceae sp.)、桑科(Moraceae sp.)、木犀科(Oleaceae sp.)、獼猴桃科(Actinidaceae sp.)、樟科(Lauraceae sp.)、芭蕉科(Musaceae sp.)(例如香蕉樹及大蕉(plantain))、茜草科(Rubiaceae sp.)、茶科(Theaceae sp.)、梧桐科(Sterculiaceae sp.)、芸香科(Rutaceae sp.)(例如檸檬、橙及柚子)；茄科(Solanaceae sp.)(例如蕃茄)、百合科(Liliaceae sp.)、菊科(Asteraceae sp.)(例如萵苣)、傘形科(Umbelliferae sp.)、十字花科(Cruciferae sp.)、藜科(Chenopodiaceae sp.)、葫蘆科(Cucurbitaceae sp.)、蝶形花

科(Papilionaceae sp.)(例如豌豆)、薔薇科(例如草莓); 主要作物, 例如禾本科(Graminae sp.)(例如玉米、草坪或諸如小麥、水稻、大麥及黑小麥等穀物)、菊科(例如向日葵)、十字花科(例如油菜)、豆科(Fabaceae sp.)(例如花生)、蝶形花科(例如大豆)、茄科(例如馬鈴薯)、藜科(例如甜菜根); 園藝及森林作物; 以及該等作物之經遺傳改造的相似物。

本發明組合物亦可用於抵抗易於在木材上或其內部生長之真菌性疾病。術語「木材」意指所有類型之木頭種類及意欲用於建築之此木頭的所有類型加工產品, 例如實木、高密度木頭、層壓木頭及膠合板。本發明處理木材之方法主要在於接觸一或多種本發明化合物或本發明組合物; 此包含(例如)直接施加、噴霧、浸泡、噴射或任何其他適宜方式。

在可藉由本發明方法控制之植物或作物疾病中, 尤其可提及:

粉病(Powdery mildew disease), 例如:

白粉病(Blumeria disease), 由(例如)禾谷白粉病菌(Blumeria graminis)引起;

單囊殼菌病(Podosphaera disease), 由(例如)白叉絲單囊殼(Podosphaera leucotricha)引起;

單絲殼菌病(Sphaerotheca disease), 由(例如)蒼耳單絲殼(Sphaerotheca fuliginea)引起;

鈎絲殼菌病(Uncinula disease), 由(例如)葡萄鈎絲殼

(*Uncinula necator*)引起；

銹病(Rust disease)，例如：

膠銹病(*Gymnosporangium disease*)，由(例如)褐色膠鏽菌(*Gymnosporangium sabinae*)引起；

咖啡銹病(*Hemileia disease*)，由(例如)咖啡駝孢鏽菌(*Hemileia vastatrix*)引起；

層銹病(*Phakopsora disease*)，由(例如)山螞蝗層鏽菌(*Phakopsora pachyrhizi*)或豆薯層鏽菌(*Phakopsora meibomiae*)引起；

柄鏽菌病(*Puccinia disease*)，由(例如)小麥隱匿柄鏽菌(*Puccinia recondita*)引起；

單胞鏽菌病(*Uromyces disease*)，由(例如)疣頂單胞鏽菌(*Uromyces appendiculatus*)引起；

卵菌病(Oomycete disease)，例如：

盤梗黴病(*Bremia disease*)，由(例如)萵苣盤梗黴(*Bremia lactucae*)引起；

霜黴病(*Peronospora disease*)，由(例如)豌豆霜黴(*Peronospora pisi*)或油菜霜黴(*P. brassicae*)引起；

疫黴病(*Phytophthora disease*)，由(例如)致病疫黴(*Phytophthora infestans*)引起；

單軸黴病(*Plasmopara disease*)，由(例如)葡萄生單軸黴(*Plasmopara viticola*)引起；

假霜黴病(*Pseudoperonospora disease*)，由(例如)漳草假霜黴(*Pseudoperonospora humuli*)或黃瓜霜黴病菌

(*Pseudoperonospora cubensis*)引起；

腐黴菌病，由(例如)終極腐黴菌引起；

葉斑病、葉皴及葉枯病，例如

鏈格孢菌病(*Alternaria disease*)，由(例如)茄鏈格孢菌(*Alternaria solani*)引起；

尾孢菌病(*Cercospora disease*)，由(例如)甜菜生尾孢菌(*Cercospora beticola*)引起；

枝孢菌病(*Cladosporium disease*)，由(例如)瓜枝孢菌(*Cladosporium cucumerinum*)引起；

旋孢腔菌病(*Cochliobolus disease*)，由(例如)禾旋孢腔菌(*Cochliobolus sativus*)引起；

毛盤孢菌病(*Colletotrichum disease*)，由(例如)菜豆毛盤孢菌(*Colletotrichum lindemuthanium*)引起；

孔雀斑病(*Cycloconium disease*)，由(例如)油橄欖孔雀斑病菌(*Cycloconium oleaginum*)引起；

間座殼菌病(*Diaporthe disease*)，由(例如)柑橘間座殼菌(*Diaporthe citri*)引起；

茄囊腔菌病(*Elsinoe disease*)，由(例如)柑橘茄囊腔菌(*Elsinoe fawcettii*)引起；

盤長孢菌病(*Gloeosporium disease*)，由(例如)桃盤長孢菌(*Gloeosporium laeticolor*)引起；

小叢殼菌病(*Glomerella disease*)，由(例如)圍小叢殼菌(*Glomerella cingulata*)引起；

球座菌病(*Guignardia disease*)，由(例如)葡萄球座菌



(*Guignardia bidwelli*)引起；

小球腔菌病 (*Leptosphaeria disease*)，由(例如)十字花科小球腔菌 (*Leptosphaeria maculans*)、穎枯殼小球腔菌 (*Leptosphaeria nodorum*)引起；

稻溫病 (*Magnaporthe disease*)，由(例如)稻瘟病菌 (*Magnaporthe grisea*)引起；

球腔菌病 (*Mycosphaerella disease*)，由(例如)禾球腔菌 (*Mycosphaerella graminicola*)、花生球腔菌 (*Mycosphaerella arachidicola*)、斐濟球腔菌 (*Mycosphaerella fijiensis*)引起；

暗球腔菌病 (*Phaeosphaeria disease*)，由(例如)穎枯殼暗球腔菌 (*Phaeosphaeria nodorum*)引起；

核腔菌病 (*Pyrenophora disease*)，由(例如)大麥核腔菌 (*Pyrenophora teres*)引起；

柱隔孢菌病 (*Ramularia disease*)，由(例如)柱隔孢菌 (*Ramularia collo-cygni*)引起；

喙孢黴病 (*Rhynchosporium disease*)，由(例如)黑麥草雲紋喙孢黴 (*Rhynchosporium secalis*)引起；

殼針孢菌病 (*Septoria disease*)，由(例如)芹菜殼針孢菌 (*Septoria apii*)或蕃茄殼針孢菌 (*Septoria lycopersici*)引起；

雪腐病 (*Typhula disease*)，由(例如)小麥雪腐病菌 (*Typhula incarnata*)引起；

黑星菌病 (*Venturia disease*)，由(例如)蘋果黑星菌 (*Venturia inaequalis*)引起；

根及莖幹疾病，例如：

伏革菌病 (*Corticium disease*)，由 (例如) 禾伏革菌 (*Corticium graminearum*) 引起；

鐮刀菌病 (*Fusarium disease*)，由 (例如) 尖孢鐮刀菌 (*Fusarium oxysporum*) 引起；

禾頂囊殼菌病 (*Gaeumannomyces disease*)，由 (例如) 禾頂囊殼菌 (*Gaeumannomyces graminis*) 引起；

絲核菌病，由 (例如) 立枯絲核菌 (*Rhizoctonia solani*) 引起；

眼斑菌病，由 (例如) 眼斑菌 (*Tapesia acuformis*) 引起；

根串珠黴病 (*Thielaviopsis disease*)，由 (例如) 菸草根串珠黴 (*Thielaviopsis basicola*) 引起；

穗及圓錐花序疾病，例如：

鏈格孢菌病，由 (例如) 鏈格孢菌屬 (*Alternaria spp.*) 引起；

曲黴菌病，由 (例如) 黃麴黴 (*Aspergillus flavus*) 引起；

枝孢菌病，由 (例如) 枝孢屬 (*Cladosporium spp.*) 引起；

麥角菌病 (*Claviceps disease*)，由 (例如) 黑麥麥角菌 (*Claviceps purpurea*) 引起；

鐮刀菌病，由 (例如) 黃色鐮刀菌 (*Fusarium culmorum*) 引起；

赤黴病 (*Gibberella disease*)，由 (例如) 玉米赤黴 (*Gibberella zeae*) 引起；

明梭孢菌病 (*Monographella disease*)，由 (例如) 雪腐明梭

孢菌 (*Monographella nivalis*) 引起；

黑穗病及腥黑穗病，例如：

軸黑粉菌病 (*Sphacelotheca disease*)，由 (例如) 玉米軸黑粉菌 (*Sphacelotheca reiliana*) 引起；

腥黑粉菌病 (*Tilletia disease*)，由 (例如) 小麥腥黑粉菌 (*Tilletia caries*) 引起；

條黑粉菌病 (*Urocystis disease*)，由 (例如) 隱性條黑粉菌 (*Urocystis occulta*) 引起；

黑粉菌病 (*Ustilago disease*)，由 (例如) 裸麥黑粉菌 (*Ustilago nuda*) 引起；

果實腐爛及發黴疾病，例如：

曲黴菌病，由 (例如) 黃麴黴引起；

葡萄孢菌病 (*Botrytis diseases*)，由 (例如) 灰葡萄孢菌 (*Botrytis cinerea*) 引起；

青黴病 (*Penicillium disease*)，由 (例如) 擴展青黴 (*Penicillium expansum*) 引起；

核盤菌病 (*Sclerotinia disease*)，由 (例如) 醉蝶菌核盤菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*) 引起；

輪枝菌病 (*Verticillium disease*)，由 (例如) 黑白輪枝菌 (*Verticillium alboatrum*) 引起；

種子及土壤傳播腐爛、發黴、枯萎、腐爛及猝倒疾病：

鏈格孢菌病 (*Alternaria disease*)，由 (例如) 甘藍鏈格孢菌 (*Alternaria brassicicola*) 引起；

絲囊黴屬病 (*Aphanomyces diseases*)，由 (例如) 根腐絲囊

黴 (*Aphanomyces euteiches*) 引起；

殼二孢屬病 (*Ascochyta diseases*)，由 (例如) 兵豆殼二孢 (*Ascochyta lentis*) 引起；

曲黴菌病，由 (例如) 黃麴黴引起；

枝孢菌病，由 (例如) 草本支孢黴 (*Cladosporium herbarum*) 引起；

旋孢腔菌病 (*Cochliobolus disease*)，由 (例如) 禾旋孢腔菌 (*Cochliobolus sativus*) 引起；

(Conidiaform: *Drechslera*, *Bipolaris* Syn: *Helminthosporium*)；

毛盤孢菌病 (*Colletotrichum disease*)，由 (例如) 辣椒炭疽病菌 (*Colletotrichum coccodes*) 引起；

鐮刀菌病，由 (例如) 黃色鐮刀菌引起；

赤黴病 (*Gibberella disease*)，由 (例如) 玉米赤黴 (*Gibberella zeae*) 引起；

亞大莖點黴屬病 (*Macrophomina diseases*)，由 (例如) 桑樹内生真菌 (*Macrophomina phaseolina*) 引起；

明梭孢菌病 (*Monographella disease*)，由 (例如) 雪腐明梭孢菌 (*Monographella nivalis*) 引起；

青黴病 (*Penicillium disease*)，由 (例如) 擴展青黴 (*Penicillium expansum*) 引起；

莖點黴屬病 (*Phoma diseases*)，由 (例如) 黑腳病菌 (*Phoma lingam*) 引起；

擬莖點黴屬病 (*Phomopsis diseases*)，由 (例如) 大豆莖點黴 (*Phomopsis sojae*) 引起；

- 疫黴病，由(例如)惡疫黴(*Phytophthora cactorum*)引起；
- 核腔菌病(*Pyrenophora disease*)，由(例如)麥類核腔菌(*Pyrenophora graminea*)引起；
- 梨孢屬病(*Pyricularia diseases*)，由(例如)稻梨孢(*Pyricularia oryzae*)引起；
- 腐黴菌病，由(例如)終極腐黴菌引起；
- 絲核菌病，由(例如)立枯絲核菌引起；
- 根黴菌屬病(*Rhizopus diseases*)，由(例如)米根黴(*Rhizopus oryzae*)引起；
- 白絹病(*Sclerotium disease*)，由(例如)白絹病菌(*Sclerotium rolfsii*)引起；
- 殼針孢屬病(*Septoria diseases*)，由(例如)小麥穎枯病病菌(*Septoria nodorum*)引起；
- 雪腐病(*Typhula disease*)，由(例如)小麥雪腐病菌(*Typhula incarnata*)引起；
- 輪枝孢屬病(*Verticillium diseases*)，由(例如)棉花黃萎病菌(*Verticillium dahliae*)引起；
- 潰瘍、開裂及梢枯病，例如：
- 叢赤殼菌病(*Nectria disease*)，由(例如)仁果癌叢赤殼菌(*Nectria galligena*)引起；
- 枯萎病，例如：
- 褐腐病(*Monilinia disease*)，由(例如)褐腐病菌(*Monilinia laxa*)引起；
- 葉皴或縮葉病，例如：

外囊菌病 (*Taphrina disease*)，由 (例如) 畸形外囊菌 (*Taphrina deformans*) 引起；

木本植物之衰退疾病，例如：

埃斯卡病 (*Esca diseases*)，由 (例如) 白色腐朽菌 (*Phaemoniella clamydospora*) 引起；

葡萄頂枯病 (*Eutypa dyeback*)，由 (例如) 葡萄藤猝倒病菌 (*Eutypa lata*) 引起；

荷蘭榆樹病 (*Dutch elm disease*)，由 (例如) 榆枯萎病菌 (*Ceratocystis ulmi*) 引起；

花及種子疾病，例如：

葡萄孢菌病，由 (例如) 灰葡萄孢菌引起；

塊莖疾病，例如：

絲核菌病，由 (例如) 立枯絲核菌引起；

長蠕孢屬病 (*Helminthosporium diseases*)，由 (例如) 茄長蠕孢菌 (*Helminthosporium solani*) 引起。

本發明之處理方法可用於處理經遺傳改造之有機體 (GMO)，例如植物或種子。經遺傳改造之植物 (或轉基因植物) 係異源基因已穩定整合入基因組中之植物。表達「異源基因」大體上意指如下基因：其提供或組合於植物外部，且在引入細胞核、葉綠體或線粒體基因組中時會藉由表現目標蛋白質或多肽或藉由下調或沉默植物中存在之其他基因 (使用 (例如) 反義技術、共阻抑技術或 RNA 干擾 - RNAi-技術) 來賦予經轉化植物新穎或改良的農藝學性質或其他性質。位於基因組中之異源基因亦稱作轉基因。植物

基因組中由特定位置界定之轉基因稱作轉化或轉基因事件。

端視植物物種或植物栽培品種、其位置及生長條件(土壤、氣候、生長期、營養)，本發明之處理亦可產生超加性(「協同」)效應。因此，舉例而言，減小施加速率及/或延伸活性譜及/或增加根據本發明可使用之活性化合物及組合物之活性，可能植物生長更好、對高溫或低溫之耐受性增加、對乾旱或水或土壤含鹽量之耐受性增加、開花性能增加、更易於收穫、加速成熟、收穫產量更高、果實更大、植物高度更高、葉色更綠、開花更早、所收穫產物之品質更好及/或營養價值更高、果實內之糖濃度更高、所收穫產物之儲存穩定性及/或加工性更佳，其超過實際預計之效應。

在某些施加速率下，本發明之活性化合物組合亦可具有強化植物之效應。因此，其亦適用於動員植物抵抗不期望植物致病真菌及/或微生物及/或病毒攻擊之防禦系統。此可(若適宜)為本發明組合增強抵抗(例如)真菌之活性的原因之一。強化植物(抗性誘導)物質在本發明上下文中應理解為意指彼等如下物質或物質組合：其能夠刺激植物之防禦系統，以便在隨後受到不期望之植物致病真菌及/或微生物及/或病毒時，經處理植物對該等不期望之植物致病真菌及/或微生物及/或病毒顯示實質程度的抗性。在本發明情形下，不期望之植物致病真菌及/或微生物及/或病毒意欲理解為意指植物致病真菌、細菌及病毒。因此，本發

明物質可用於保護植物，使其可在處理之後某一時間內抵抗上述病原體之攻擊。在使用活性化合物處理植物之後，實現保護之時間通常自1天延伸至10天，較佳地自1天延伸至7天。

根據本發明處理之較佳植物及植物栽培品種包括具有賦予該等植物尤其有利的有用特性之遺傳材料(不論藉由育種及/或生物技術方式獲得)的所有植物。

根據本發明處理之較佳植物及植物栽培品種亦可抵抗一或多種生物性逆境，亦即該等植物對諸如以下動物及微生物有害生物顯示較佳防禦：線蟲、昆蟲、蟎、植物致病真菌、細菌、病毒及/或類病毒。

亦可根據本發明處理之植物及植物栽培品種係彼等抵抗一或多種非生物性逆境之植物。非生物性逆境條件可包含(例如)乾旱、冷溫暴露、熱暴露、滲透應力、水患、土壤鹽度增加、礦物暴露增加、臭氧暴露、強光暴露、氮營養素可用性受限、磷營養素可用性受限、避蔭。

亦可根據本發明處理之植物及植物栽培品種係彼等特徵在於已增強產量特性之植物。該等植物之產量增加之原因可為(例如)改進植物生理學、生長及發育(例如水使用效率、水保持效率)、改進氮使用率、增強碳同化率、改進光合作用、提高發芽效率及加速成熟。產量可進一步受改進之植物結構(在應力及非應力條件下)影響，包含但不限於提早開花、對於雜合體種子生產之開花控制、幼苗優勢、植物大小、節間數目及距離、根生長、種子大小、果



實大小、豆莢大小、豆莢或穗部數目、每個豆莢或穗部之種子數、種子質量、提高種子飽實度、降低種子分散、減少豆莢分裂，及抗倒伏性。其他產量特性包含種子組成(例如碳水化合物含量、蛋白質含量、油含量及組成)、營養價值、抗營養化合物減少、改進處理性及提高儲存穩定性。

可根據本發明處理之植物係如下雜合體植物：其已表現混種盛勢或雜合體優勢特性從而通常得到較高產量、優勢、健康及對於生物性及非生物性逆境因素之抗性。該等植物通常係藉由近交雄性不育親系(雌性親本)與另一近交雄性不育親系(雄性親本)雜交獲得。雜合體種子通常係自雄性不育植物收穫並出售給栽培者。雄性不育植物有時可(例如在玉米中)藉由去雄產生，亦即機械去除雄性生殖器官(或雄花)，但更通常而言，雄性不育性係由植物基因組中之遺傳定子產生。在該情形下，且尤其在種子係欲自雜合體植物收穫之期望產物時，其通常用於確保雜合體植物得以完全恢復雄性能育性。此可藉由確保雄性親本具有適當能育性恢復基因來達成，該等能育性恢復基因能夠恢復含有造成雄性不育性之遺傳定子之雜合體植物中的雄性能育性。用於雄性不育性之遺傳定子可位於細胞質中。細胞質雄性不育性(CMS)之實例闡述於(例如)芸苔屬(*Brassica*)物種中(WO 1992/005251、WO 1995/009910、WO 1998/27806、WO 2005/002324、WO 2006/021972及US 6,229,072)。然而，用於雄性不育性之遺傳定子亦可位於細胞核基因組中。雄性

不育植物亦可藉由植物生物技術方法(例如遺傳工程)獲得。獲得雄性不育植物之尤其有用方式闡述於WO 1989/10396中，其中，舉例而言，核糖核酸酶(例如芽孢桿菌RNA酶(barnase))選擇性表現於雄蕊中之毯氈層細胞中。然後可藉由在毯氈層細胞中表現諸如芽孢桿菌RNA酶抑制劑(barstar)之核糖核酸酶抑制劑而得以恢復能育性(例如WO 1991/002069)。

可根據本發明處理之植物或植物栽培品種(藉由植物生物技術方法獲得，例如遺傳工程)係除草劑耐受性植物，亦即耐受一或多種特定除草劑之植物。該等植物可藉由遺傳轉化獲得，或藉由選擇含有賦予該除草劑耐受性之突變之植物獲得。

除草劑耐受性植物係(例如)草甘膦(glyphosate)耐受性植物，亦即耐受除草劑草甘膦或其鹽之植物。可經由不同方式使植物耐受草甘膦。舉例而言，草甘膦耐受性植物可藉由使用編碼酵素5-烯醇丙酮醯莽草酸-3-磷酸合酶(EPSPS)之基因轉化植物來獲得。該等EPSPS基因之實例係細菌鼠傷寒沙門氏菌(*Salmonella typhimurium*)之AroA基因(突變體CT7)(Comai等人，*Science* (1983), 221, 370-371)、細菌土壤桿菌屬(*Agrobacterium* sp.)之CP4基因(Barry等人，*Curr. Topics Plant Physiol.*(1992), 7, 139-145)、編碼矮牽牛EPSPS(Shah等人，*Science* (1986), 233, 478-481)、蕃茄EPSPS(Gasser等人，*J. Biol. Chem.* (1988), 263, 4280-4289)、或EPSPS (WO 2001/66704) 之基因。其亦可為突變之EPSPS，如

(例如)EP-A 0837944、WO 2000/066746、WO 2000/066747或WO 2002/026995中所述。草甘膦耐受性植物亦可藉由表現編碼草甘膦氧化還原酶之基因來獲得，如US 5,776,760及US 5,463,175中所述。草甘膦耐受性植物亦可藉由表現編碼草甘膦乙醯基轉移酶之基因來獲得，如(例如)WO 2002/036782、WO 2003/092360、WO 2005/012515及WO 2007/024782中所述。草甘膦耐受性植物亦可藉由選擇含有天然存在之上述基因突變之植物來獲得，如(例如)WO 2001/024615或WO 2003/013226中所述。其他除草劑抗性植物係(例如)耐受可抑制酵素麩胺醯胺合酶之除草劑(例如雙丙胺磷(bialaphos)、草胺膦(phosphinothricin)或草丁膦(glufosinate))的植物。該等植物可藉由表現將除草劑解毒之酶或抵抗該抑制作用之突變體麩胺醯胺合酶來獲得。一種此類有效解毒酶係編碼草胺膦乙醯基轉移酶之酶(例如來自鏈黴菌屬(*Streptomyces*)物種之bar或pat蛋白質)。表現外源草胺膦乙醯基轉移酶之植物(例如)闡述於US 5,561,236、US 5,648,477、US 5,646,024、US 5,273,894、US 5,637,489、US 5,276,268、US 5,739,082、US 5,908,810及US 7,112,665中。

其他除草劑耐受性植物亦係耐受可抑制酵素羥基苯基丙酮酸雙加氧酶(HPPD)之除草劑的植物。

羥基苯基丙酮酸雙加氧酶係催化將丙酮酸對羥基苯基酯(HPP)轉化成尿黑酸酯之反應的酶。耐受HPPD抑制劑之植物可使用編碼天然存在之抗HPPD酶之基因、或編碼突變

HPPD 酶之基因來轉化，如 WO 1996/038567、WO 1999/024585及WO 1999/024586中所述。對HPPD抑制劑之耐受性亦可藉由使用編碼某些使得能夠形成尿黑酸酯之酶的基因轉化植物來獲得，儘管HPPD抑制劑可抑制天然HPPD酶。該等植物及基因闡述於WO 1999/034008及WO 2002/36787中。除使用編碼HPPD耐受性酶之基因外，亦可藉由使用編碼酵素預苯酸脫氫酶之基因轉化植物來改進植物對於HPPD抑制劑之耐受性，如WO 2004/024928中所述。

其他除草劑抗性植物係耐受乙醯乳酸合酶(ALS)抑制劑之植物。已知ALS抑制劑包含(例如)磺醯脲、咪唑啉酮、三唑并嘧啶、嘧啶基氧基(硫代)苯甲酸酯、及/或磺醯基胺基羰基三唑啉酮除草劑。ALS酶(亦稱作乙醯羧酸合酶，AHAS)之不同突變已知會賦予不同除草劑及除草劑群耐受性，如(例如)Tranel及Wright, Weed Science (2002), 50, 700-712以及US 5,605,011、US 5,378,824、US 5,141,870、及US 5,013,659中所述。磺醯脲耐受性植物及咪唑啉酮耐受性植物之產生闡述於US 5,605,011、US 5,013,659、US 5,141,870、US 5,767,361、US 5,731,180、US 5,304,732、US 4,761,373、US 5,331,107、US 5,928,937、及US 5,378,824、及國際公開案WO 1996/033270中。其他咪唑啉酮耐受性植物亦闡述於(例如)WO 2004/040012、WO 2004/106529、WO 2005/020673、WO 2005/093093、WO 2006/007373、WO 2006/015376、WO 2006/024351、及WO

2006/060634中。其他磺醯脲-及咪唑啉酮耐受性植物亦闡述於(例如)WO 2007/024782中。

其他耐受咪唑啉酮及/或磺醯脲之植物可藉由誘導突變、在除草劑存在下選擇細胞培養物或突變育種獲得，如(例如)US 5,084,082(對於大豆)、WO 1997/41218(對於水稻)、US 5,773,702及WO 1999/057965(對於甜菜)、US 5,198,599(對於萵苣)、或WO 2001/065922(對於向日葵)中所述。

亦可根據本發明處理之植物或植物栽培品種(藉由植物生物技術方法獲得，例如遺傳工程)係昆蟲抗性轉基因植物，亦即抵抗某些目標昆蟲之攻擊之植物。該等植物可藉由遺傳轉化、或藉由選擇含有賦予該昆蟲抗性之突變的植物來獲得。

本文所用之「昆蟲抗性轉基因植物」包含任一含有至少一個轉基因之植物，該轉基因包括編碼以下之編碼序列：

- 1) 來自蘇雲金桿菌(*Bacillus thuringiensis*)之殺昆蟲晶體蛋白質或其殺昆蟲部分，例如Crickmore等人，*Microbiology and Molecular Biology Reviews* (1998), 62, 807-813(由Crickmore等人(2005)在蘇雲金桿菌毒素命名法中更新，在網址：[http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil\\_Crickmore/Bt/](http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/))所列示之殺昆蟲晶體蛋白質、或其殺昆蟲部分，例如，Cry蛋白質類Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry2Ab、Cry3Aa、或Cry3Bb之蛋白質或其殺昆蟲部分；或
- 2) 在來自蘇雲金桿菌之另一第二晶體蛋白質或其部分存在下具有殺昆蟲性之來自蘇雲金桿菌之晶體蛋白質或

其殺昆蟲部分，例如由Cry34及Cry35晶體蛋白質構成之二元毒素(Moellenbeck等人，Nat. Biotechnol. (2001), 19, 668-72；Schnepf等人，Applied Environm. Microbiol. (2006), 71, 1765-1774)；或

3) 包括來自蘇雲金桿菌之不同殺昆蟲晶體蛋白質部分之雜合體殺昆蟲蛋白質，例如上文1)中蛋白質之雜合體或上文2)中蛋白質之雜合體，例如由玉米品種MON98034產生之Cry1A.105蛋白質(WO 2007/027777)；或

4) 上文1)至3)中任一者之蛋白質，其中一些、尤其1至10個胺基酸經另一胺基酸代替以獲得針對目標昆蟲物種之較高殺昆蟲活性，及/或擴展所影響目標昆蟲物種之範圍，及/或由於在選殖或轉化期間引入編碼DNA中之變化而發生此代替，例如玉米品種MON863或MON88017中之Cry3Bb1蛋白質，或玉米品種MIR604中之Cry3A蛋白質；

5) 自蘇雲金桿菌或蠟狀芽孢桿菌(*Bacillus cereus*)之殺昆蟲分泌蛋白、其或殺昆蟲部分，例如在[http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil\\_Crickmore/Bt/vip.html](http://www.lifesci.sussex.ac.uk/home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html)中列示之植物性殺昆蟲(VIP)蛋白，例如，來自VIP3Aa蛋白類之蛋白；或

6) 來自蘇雲金桿菌或蠟狀芽孢桿菌之如下分泌蛋白：其在來自蘇雲金桿菌或蠟狀芽孢桿菌之第二分泌蛋白存在下具有殺昆蟲性，例如由VIP1A及VIP2A蛋白質構成之二元毒素(WO 1994/21795)；或

7) 包括來自蘇雲金桿菌或蠟狀芽孢桿菌之不同分泌蛋白質部分之雜合體殺昆蟲蛋白，例如上文1)中蛋白質之雜合體或上文2)中蛋白質之雜合體；或

8) 1)至3)中任一者之蛋白質，其中有些(尤其1至10個)胺基酸已經另一胺基酸代替以獲得針對目標昆蟲物種之較高殺昆蟲活性，及/或擴展所影響目標昆蟲物種之範圍，及/或因為已在選殖或轉化(同時仍編碼殺昆蟲蛋白質)期間將變化引入編碼DNA中，例如玉米品種COT102中之VIP3Aa蛋白。

當然，本文所用之昆蟲抗性轉基因植物亦包含包括編碼上述種類1至8中任一者之蛋白質之基因組合的任一植物。在一實施例中，昆蟲抗性植物含有一種以上編碼上述種類1至8中任一者之蛋白質的轉基因，從而在使用針對不同目標昆蟲物種之不同蛋白質時可擴展受影響目標昆蟲物種之範圍，或用以藉由使用對相同目標昆蟲物種具有殺昆蟲性但具有不同作用模式(例如結合昆蟲中之不同受體結合位點)之不同蛋白質來延遲植物的昆蟲抗性發展。

亦可根據本發明處理之植物或植物栽培品種(藉由植物生物技術方法獲得，例如遺傳工程)可耐受非生物性逆境。該等植物可藉由遺傳轉化來獲得，或藉由選擇含有賦予該應力抗性之突變之植物來獲得。尤其有用之應力耐受性植物包含：

- a. 含有能夠減小植物細胞或植物中聚(ADP-核糖)聚合酶(PARP)基因之表現及/或活性之轉基因的植物，如 WO

2000/004173 或 WO2006/045633 或 PCT/EP07/004142 中所述。

- b. 含有可增強能夠減小植物或植物細胞中PARG編碼基因之表現及/或活性之轉基因之應力耐受性的植物，如(例如)WO 2004/090140中所述。
- c. 含有可增強菸鹼胺腺嘌呤二核苷酸分段合成路徑之植物功能酶之轉基因編碼之應力耐受性的植物，該植物功能酶包含菸鹼胺酶、菸鹼酸磷酸核糖基轉移酶、菸酸單核苷酸腺苷轉移酶、菸鹼胺腺嘌呤二核苷酸合成酶或菸鹼鹼胺磷酸核糖轉移酶，如(例如)WO2006/032469或WO 2006/133827或PCT/EP07/002433中所述。

亦可根據本發明處理之植物或植物栽培品種(藉由植物生物技術方法獲得，例如遺傳工程)顯示已改變所收穫產物之數量、品質及/或儲存穩定性，及/或改變所收穫產物之具體成份的性質，例如：

- 1) 合成改良澱粉之轉基因植物，其物理化學特性、尤其直鏈澱粉含量或直鏈澱粉/支鏈澱粉比率、分枝程度、平均鏈長、側鏈分佈、黏度行為、膠凝強度、澱粉顆粒大小及/或澱粉顆粒形態與野生型植物細胞或植物中之合成澱粉相比有所改變，從而其更適用於具體應用。該等合成改良澱粉之轉基因植物揭示於諸如以下條件中：EP 0571427、WO 1995/004826、EP 0719338、WO 1996/15248、WO 1996/19581、WO 1996/27674、



WO 1997/11188、WO 1997/26362、WO 1997/32985、  
WO 1997/42328、WO 1997/44472、WO 1997/45545、  
WO 1998/27212、WO 1998/40503、WO99/58688、WO  
1999/58690、WO 1999/58654、WO 2000/008184、WO  
2000/008185、WO 2000/008175、WO 2000/28052、WO  
2000/77229、WO 2001/12782、WO 2001/12826、WO  
2002/101059、WO 2003/071860、WO 2004/056999、WO  
2005/030942、WO 2005/030941、WO 2005/095632、WO  
2005/095617、WO 2005/095619、WO 2005/095618、WO  
2005/123927、WO 2006/018319、WO 2006/103107、WO  
2006/108702、WO 2007/009823、WO 2000/22140、WO  
2006/063862、WO 2006/072603、WO 2002/034923、EP  
06090134.5、EP 06090228.5、EP 06090227.7、EP  
07090007.1、EP 07090009.7、WO 2001/14569、WO  
2002/79410、WO 2003/33540、WO 2004/078983、WO  
2001/19975、WO 1995/26407、WO 1996/34968、WO  
1998/20145、WO 1999/12950、WO 1999/66050、WO  
1999/53072、US 6,734,341、WO 2000/11192、WO  
1998/22604、WO 1998/32326、WO 2001/98509、WO  
2001/98509、WO 2005/002359、US 5,824,790、US  
6,013,861、WO 1994/004693、WO 1994/009144、WO  
1994/11520、WO 1995/35026、WO 1997/20936。

2) 合成非澱粉碳水化合物聚合物之轉基因植物，或合  
成非澱粉碳水化合物聚合物且與並未進行遺傳改造之野

生型植物相比具有改變性質之轉基因植物。實例係產生多聚果糖(尤其菊糖及果聚糖型)之植物(如EP 0663956、WO 1996/001904、WO 1996/021023、WO 1998/039460、及WO 1999/024593中所揭示)、產生 $\alpha$ 1,4葡聚糖之植物(如WO 1995/031553、US 2002/031826、US 6,284,479、US 5,712,107、WO 1997/047806、WO 1997/047807、WO 1997/047808及WO 2000/014249中所揭示)、產生 $\alpha$ -1,6支鏈 $\alpha$ -1,4-葡聚糖之植物(如WO 2000/73422中所揭示)、產生蓮子草(alternan)之植物(如WO 2000/047727、EP 06077301.7、US 5,908,975及EP 0728213中所揭示),

3) 產生透明質酸之轉基因植物, 如(例如)WO 2006/032538、WO 2007/039314、WO 2007/039315、WO 2007/039316、JP 2006/304779、及WO 2005/012529中所揭示。

亦可根據本發明處理之植物或植物栽培品種(可藉由植物生物技術方法獲得, 例如遺傳工程)係具有改變之纖維特性之植物, 例如棉花植物。該等植物可藉由遺傳轉化來獲得, 或藉由選擇含有賦予該改變纖維特性之突變的植物來獲得, 且包含:

- a) 含有改變形式纖維素合酶基因之植物, 例如棉花植物, 如WO 1998/000549中所述
- b) 含有改變形式rsw2或rsw3同源核酸之植物, 例如棉花植物, 如WO 2004/053219中所述
- c) 增加蔗糖磷酸合酶之表現之植物, 例如棉花植物, 如

WO 2001/017333 中所述

- d) 增加蔗糖合酶之表現之植物，例如棉花植物，如 WO 02/45485 中所述
- e) 基於纖維細胞之胞間連絲門控之時間發生改變(例如經由下調纖維選擇性 $\beta$  1,3-葡聚糖酶)之植物，例如棉花植物，如 WO 2005/017157 中所述
- f) 纖維反應性有所改變(例如經由表現包含 nodC 之 N-乙酰基葡糖胺轉移酶基因及殼多糖合酶基因)之植物，例如棉花植物，如 WO 2006/136351 中所述

亦可根據本發明處理之植物或植物栽培品種(可藉由植物生物技術方法獲得，例如遺傳工程)係具有改變之油特性之植物，例如油菜或相關芸苔屬植物。該等植物可藉由遺傳轉化來獲得，或藉由選擇含有賦予該改變之油特性之突變的植物來獲得，且包含：

- a) 產生具有高油酸含量之油之植物，例如油菜植物，如(例如)US 5,969,169、US 5,840,946 或 US 6,323,392 或 US 6,063,947 中所述
- b) 產生具有低亞麻酸含量之油之植物，例如油菜植物，如 US 6,270,828、US 6,169,190 或 US 5,965,755 中所述
- c) 產生具有低含量飽和脂肪酸之油之植物，例如油菜植物，如(例如)US 5,434,283 中所述

可根據本發明處理之尤其有用之轉基因植物係包括一或多種編碼一或多種毒素之基因的植物，例如以下列商品名出售之下列植物：YIELD GARD®(例如玉米、棉花、大

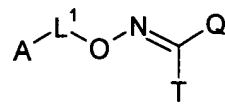
豆)、KnockOut®(例如玉米)、BiteGard®(例如玉米)、Bt-Xtra®(例如玉米)、StarLink®(例如玉米)、Bollgard®(棉花)、NucoIn®(棉花)、NucoIn 33B®(棉花)、NatureGard®(例如玉米)、Protecta®及NewLeaf®(馬鈴薯)。可提及之除草劑耐受性植物的實例係玉米變種、棉花變種及大豆變種，該等實例係以下列商品名出售：Roundup Ready®(耐受草甘膦，例如玉米、棉花、大豆)、Liberty Link®(耐受草胺膦，例如油菜)、IMI®(耐受咪唑啉酮)及STS®(耐受磺酰脲，例如玉米)。可提及之除草劑抗性植物(以習用方式育種以獲得除草劑耐受性之植物)包含以名稱Clearfield®(例如玉米)出售之變種。

可根據本發明處理之尤其有用之轉基因植物係含有轉化事件、或轉化事件組合的植物，其列示於(例如)來自各個國家或地區管理機構的數據庫(參見(例如)[http://gmoinfo.jrc.it/gmp\\_browse.aspx](http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx)及<http://www.agbios.com/dbase.php>)。

本發明化合物亦可用於製備用於治療性或預防性治療人類或動物真菌疾病的組合物，該等人類或動物真菌疾病係(例如)黴菌病、皮膚病、發癬及念珠菌病或由曲黴菌(例如菸曲黴菌(*Aspergillus fumigatus*))引起之疾病。

現將參照下表1之化合物實例及下列製備或功效實例來闡釋本發明的各個態樣。

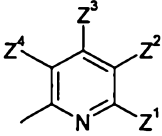
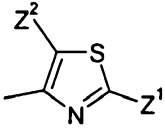
下表1以非限制性方式闡釋本發明化合物之實例。



(I)

在表1中，M+H (ApcI+)意指如經由正大氣壓化學電離在質譜中所觀察的分子離子峰加1 a.m.u.(原子質量單位)。

在表1中，使用下列縮寫用於本發明一般結構(I)之指定且要求之要素「A」：

A <sup>2</sup>	A <sup>16</sup>
	 <p data-bbox="576 958 1062 1068">在表1中A=A<sup>16</sup>之所有情形下， Z<sup>3</sup>及Z<sup>4</sup>不存在且為空</p>





































下列實例以非限制性方式闡釋本發明式(I)化合物之製備及功效。

製備實例1：{6-[[([氫基(苯基)亞甲基]胺基)氧基)甲基]吡啶-2-基}胺基甲酸丁-3-炔-1-基酯(化合物3)

步驟1： $\alpha$ -(羥基亞胺基)(苯基)乙腈之鈉鹽之製備

向存於50 ml乙醇中之3.3 g (83 mmol)氫氧化鈉的懸浮液中添加9.7 g (83 mmol)苯基乙腈。攪拌反應混合物直至固體完全溶解為止。在溫度維持於低於15°C下時，然後緩慢添加存於10 ml乙醇中之11.7 g (100 mmol)亞硝戊酯的溶液。將反應混合物在環境溫度下進一步攪拌2 hr。藉由100 ml二乙醚稀釋反應混合物。過濾所獲得之固體，藉由二乙醚洗滌並乾燥以得到7.89 g(產率為56%)白色固體形式之 $\alpha$ -(羥基亞胺基)(苯基)-乙腈的純鈉鹽。熔點(mp)：>200°C。

步驟2：{6-[[([Z)-氫基(苯基)亞甲基]胺基)氧基)甲基]吡啶-2-基}胺基甲酸丁-3-炔-1-基酯之製備

向存於25 ml乙腈中之1.05 g (6.25 mmol)  $\alpha$ -(羥基亞胺基)-(苯基)乙腈之鈉鹽的懸浮液中連續添加溶於2.5 ml N,N-二甲基-甲醯胺中之104 mg (0.625 mmol)碘化鉀及1.49 g (6.25 mmol) [6-(氫甲基)吡啶-2-基]胺基甲酸丁-3-炔-1-基酯。將反應混合物在環境溫度下攪拌16 hr。在真空下去除溶劑且添加100 ml乙酸乙酯。藉由鹽水洗滌有機層，藉由硫酸鎂乾燥且使用二異丙醚使在濃縮之後獲得之殘餘物結晶以得到2.21 g(產率為99%)白色固體形式之{6-[[([Z)-氫基(苯基)亞甲基]胺基)-氧基)甲基]吡啶-2-基}胺基甲酸丁-

3-炔-1-基酯的一種單一異構體(M+H=349)。mp: 76°C。

製備實例2：{6-[[{(2-(甲基胺基)-2-側氧基-1-苯基亞乙基]胺基}氧基)-甲基]吡啶-2-基}胺基甲酸戊基酯(化合物63)

步驟1：2-{[(6-胺基吡啶-2-基)甲氧基]亞胺基}-N-甲基-2-苯基乙醯胺之製備

將存於5 ml異丙醇中之461 mg (2.83 mmol) N-甲基-2-側氧基-2-苯基乙醯胺、328 mg (2.36 mmol) 6-[(胺基氧基)甲基]吡啶-2-胺及493 mg (2.6 mmol)一水合4-甲苯磺酸的均勻混合物在160°C下於微波裝置中加熱1 hr。然後將粗製混合物冷卻至環境溫度並藉由二氯甲烷進行萃取。藉由碳酸鈉溶液洗滌有機層，藉由矽藻土過濾並濃縮。實施管柱層析(二氯甲烷/甲醇梯度)以得到479 mg(產率為71%)黃色油狀物形式之2-{[(6-胺基吡啶-2-基)甲氧基]亞胺基}-N-甲基-2-苯基乙醯胺的68/32 Z/E混合物(M+H=285)。

步驟2：{6-[[{(2-(甲基胺基)-2-側氧基-1-苯基亞乙基]胺基}氧基)-甲基]-吡啶-2-基}-胺基甲酸戊基酯之製備

向存於5 ml 1,4-二噁烷中之112 mg (0.71 mmol)氯甲酸正戊基酯及60 mg (0.77 mmol)吡啶的混合物中添加168 mg 2-{[(6-胺基吡啶-2-基)甲氧基]亞胺基}-N-甲基-2-苯基乙醯胺之68/32 Z/E混合物。將反應混合物在環境溫度下攪拌16hr。在真空下去除溶劑，且藉由管柱層析(庚烷/乙酸乙酯梯度)純化粗製物以得到221 mg(產率為93%)油狀物形式之{6-[[{(2-(甲基胺基)-2-側氧基-1-苯基亞乙基]胺基}氧

基)甲基]-吡啶-2-基}-胺基甲酸戊基酯的69/31 Z/E混合物 (M+H=399)。

實例 A：疫黴測試(蕃茄)/預防

溶劑： 49重量份數之N,N-二甲基甲醯胺

乳化劑： 1重量份數之烷基芳基聚乙二醇醚

為產生活性化合物之適宜製劑，使1重量份數之活性化合物與規定量之溶劑及乳化劑混合，且使用水將濃縮物稀釋至期望濃度。

為測試預防性活性，使用活性化合物之製劑在規定施加速率下對幼小植物進行噴霧。實施此處理1天後，向植物注射致病疫黴之水性孢子懸浮液。將植物在約22°C及100%相對大氣濕度之培育櫥中保持1天。然後將植物置於約20°C及96%相對大氣濕度之培育櫥中。

在注射7天後，對測試進行評估。0%意指功效與未處理對照之功效相當，而100%之功效意指未觀察到疾病。

在此測試中，來自表A之本發明下列化合物顯示在500 ppm活性成份之濃度下功效為70%或甚至更高。

表 A：

實例	功效	實例	功效	實例	功效
75	85	101	95	112	100
98	85	109	98	129	92
99	95	110	70	130	100
100	70	111	92		



發明專利說明書

(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： 99146426

※申請日： 99-12-28 ※IPC 分類：C07D; A01N; A01P

一、發明名稱：(中文/英文)

殺真菌劑肟基(HYDROXIMOYL)-雜環衍生物

FUNGICIDE HYDROXIMOYL-HETEROCYCLES DERIVATIVES

A01N 33/16  
A01N 37/18 (2006.01)  
A01P 3/00 (2006.01)

二、中文發明摘要：

本發明係關於肟基(hydroximoyl)-雜環衍生物、其製備方法、其作為殺真菌劑活性劑(尤其呈殺真菌劑組合物形式)之用途、及使用該等化合物或組合物控制尤其植物之植物致病真菌之方法。

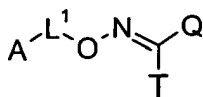
三、英文發明摘要：

The present invention relates to hydroximoyl-heterocycle derivatives, their process of preparation, their use as fungicide active agents, particularly in the form of fungicide compositions, and methods for the control of phytopathogenic fungi, notably of plants, using these compounds or compositions.

**四、指定代表圖：**

(一)本案指定代表圖為：(無)

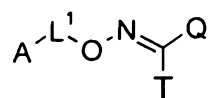
(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

**五、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：**

(I)

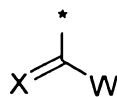
## 七、申請專利範圍：

1. 一種式(I)化合物，



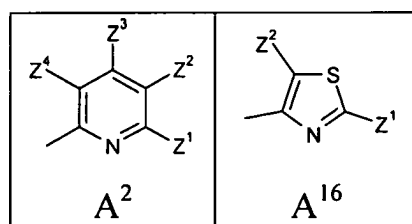
(I)

其中

T係式T<sup>a</sup>之基團(T<sup>a</sup>)

其中

X代表氧原子；

W代表未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基胺基或未經取代之二-(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>)-烷基胺基；L<sup>1</sup>代表-CH<sub>2</sub>-；A選自由A<sup>2</sup>及A<sup>16</sup>組成之列表：

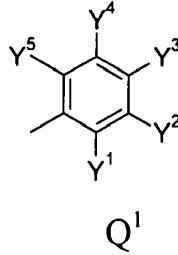
其中

Z<sup>1</sup>代表未經取代之(C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷氧基羰基)-胺基、未經取代之(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-炔氧基羰基)胺基、未經取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基羰基、經芳氧基或烷氧基芳基取代之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基羰基、未經取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代

烷基羰基胺基、經芳氧基取代之具有1至5個鹵素原子之C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-鹵代烷基羰基胺基、未經取代之雜環基羰基胺基；

Z<sup>2</sup>、Z<sup>3</sup>及Z<sup>4</sup>獨立地代表氫原子；

Q選自由Q<sup>1</sup>組成之列表：

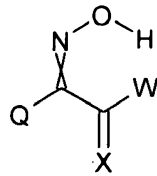


其中

Y<sup>1</sup>至Y<sup>5</sup>獨立地代表氫原子；

以及其鹽或其(E)及(Z)異構體及混合物。

2. 一種式(IIa)化合物，



(IIa)

其中Q係未經取代之苯基，X代表氧原子，且W係未經取代之胺基或可經一或兩個下列相似或不同基團取代之胺基：C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基，其中不包含：

- 2-(羥基亞胺基)-2-苯基-N-丙基乙醯胺，
- 2-(羥基亞胺基)-N,N-二甲基-2-苯基乙醯胺，
- 2-(羥基亞胺基)-N-異丙基-2-苯基乙醯胺，
- 2-(羥基亞胺基)-N-甲基-2-苯基乙醯胺，
- N,N-二乙基-2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯胺，

N-丁基-2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯胺，

N-乙基-2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯胺，

N-庚基-2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯胺，

N-第三-丁基-2-(羥基亞胺基)-2-苯基乙醯胺。

3. 一種殺真菌劑組合物，其包括有效量之如請求項1之式(I)化合物作為活性成份及農業上可接受之載體、載劑或填充劑。
4. 一種控制植物、作物或種子之植物致病真菌之方法，其特徵在於將農藝學有效且實質上非植物毒性量之如請求項1之化合物或如請求項3之殺真菌劑組合物施加至植物生長或能夠生長的土壤、植物的葉子及/或果實或植物種子上。