

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： 87114041 A01N⁴³/836 (2006.01,

※ 申請日期： 87.4.18 ※IPC 分類： C07D²⁸⁵/08 (2006.01,

一、發明名稱：(中文/英文) A01P³/00 (2006.01,

噻二唑基氧苯基脒及其作為殺真菌劑之用途

THIADIAZOLYLOXYPHENYLAMIDINES AND THE USE THEREOF AS
FUNGICIDES

二、申請人：(共 1 人)

姓名或名稱：(中文/英文)

拜耳作物科學股份有限公司

BAYER CROPSCIENCE AKTIENGESELLSCHAFT

代表人：(中文/英文)

1.包亞歷/BADER, AXEL

2.傑羅夫/JESSE, RALF-RUEDIGER

住居所或營業所地址：(中文/英文)

德國莫罕城艾諾貝耳街 50 號

Alfred-Nobel-Str. 50, 40789 Monheim, Germany

國 籍：(中文/英文)

德國/GERMANY

三、發明人：(共 15 人)

姓 名：(中文/英文)

1.庫恩斯/KUNZ, KLAUS

2.當克爾/DUNKEL, RALF

3.葛瑞爾/GREUL, JOERG NICO

4.奧利佛/GUTH, OLIVER

5.哈特曼/HARTMANN, BENOIT

6.克斯汀/ILG, KERSTIN

7. 摩爾帝/MORADI, WAHED AHMED
8. 湯瑪士/SEITZ, THOMAS
9. 羅納德/EBBERT, RONALD
10. 戴哈曼/DAHMEN, PETER
11. 亞恩德/VOERSTE, ARND
12. 巫理克/WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE
13. 法蘭肯/FRANKEN, EVA-MARIA
14. 馬山姆/MALSAM, OLGA
15. 克勞斯/TIETJEN, KLAUS

國 籍：(中文/英文)

1.-4.及 6.-15.為德國/GERMANY

5.為法國/FRANCE

四、聲明事項：

☐ 主張專利法第二十二條第二項 ☐ 第一款或 ☐ 第二款規定之事實，其實發生日期為： 年 月 日。

☒ 申請前已向下列國家(地區)申請專利：

【格式請依：受理國家(地區)、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

歐洲專利公約；西元 2007 年 04 月 19 日；07007980.1

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

7. 摩爾帝/MORADI, WAHED AHMED
8. 湯瑪士/SEITZ, THOMAS
9. 羅納德/EBBERT, RONALD
10. 戴哈曼/DAHMEN, PETER
11. 亞恩德/VOERSTE, ARND
12. 巫理克/WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE
13. 法蘭肯/FRANKEN, EVA-MARIA
14. 馬山姆/MALSAM, OLGA
15. 克勞斯/TIETJEN, KLAUS

國 籍：(中文/英文)

1.-4.及 6.-15.為德國/GERMANY

5.為法國/FRANCE

四、聲明事項：

☐ 主張專利法第二十二條第二項 ☐ 第一款或 ☐ 第二款規定之事實，其實發生日期為： 年 月 日。

☒ 申請前已向下列國家(地區)申請專利：

【格式請依：受理國家(地區)、申請日、申請案號 順序註記】

☒ 有主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

歐洲專利公約；西元 2007 年 04 月 19 日；07007980.1

☐ 無主張專利法第二十七條第一項國際優先權：

☐ 主張專利法第二十九條第一項國內優先權：

【格式請依：申請日、申請案號 順序註記】

☐ 主張專利法第三十條生物材料：

☐ 須寄存生物材料者：

國內生物材料 【格式請依：寄存機構、日期、號碼 順序註記】

國外生物材料 【格式請依：寄存國家、機構、日期、號碼 順序註記】

☐ 不須寄存生物材料者：

所屬技術領域中具有通常知識者易於獲得時，不須寄存。

九、發明說明：

【發明所屬之技術領域】

本發明關於具式(I)之噻二唑基氧苯基脒類、製備其之方法、使用根據本發明之脒類(amidines)用於對抗不想要的微生物之方法以及關於此目的之一種組成物，其係包含根據本發明之噻二唑基氧苯基脒類，本發明也關於一種供對抗不想要的微生物之方法，係藉由施用根據本發明之化合物至微生物及/或其生活環境。

【先前技術】

WO-A-00/046 184 揭露使用脒類(amidines)作為殺真菌劑之用途。

WO-A-03/093 224 揭露使用芳基脒衍生物類作為殺真菌劑之用途。

WO-A-03/024 219 揭露包含至少一種 N2-苯基脒衍生物，併用一種另外地挑選自己知的活性物質之殺真菌的組成物。

WO-A-04/037 239 揭露以 N2-苯基脒衍生物類為主之殺真菌的醫藥品。

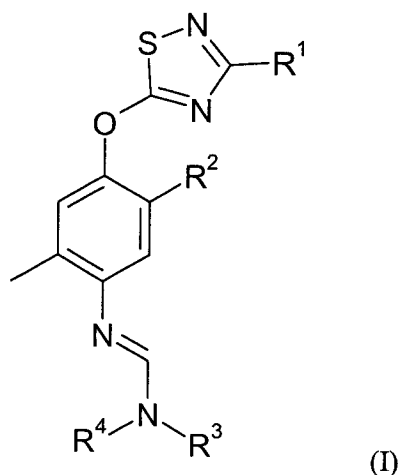
WO-A-07/031 513 揭露經噻二唑基-取代的苯基脒類及其製備及以其用作為殺真菌劑的用途。

在文獻中被揭露的脒類之有效性不錯，但在許多情況下仍有不足。

因此本發明的目標為，取得具有增進的有效性的脒類。

【發明內容】

令人驚訝地，本目標可藉由使用具式(I)之噻二唑基氧苯基脒類達成



其中

R^1 為第三-丁基；

R^2 為挑選自包括甲基、 C_{1-6} -鹵基烷基及鹵素之基；

R^3 為甲基，且

R^4 為挑選自包括乙基及異丙基之基；

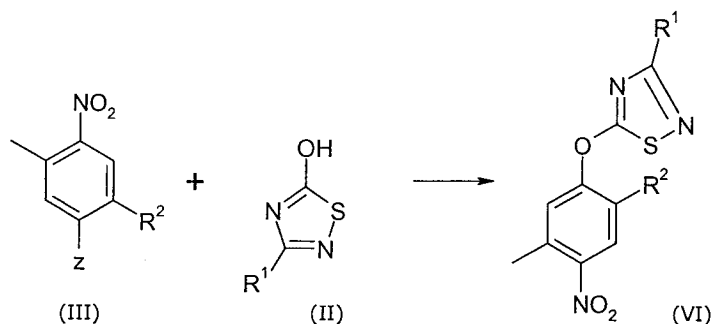
或其中

R^4 及 R^3 與彼等被附接的氮原子，一起形成一種六氫吡啶基、吡咯啉基或 2,6-二甲基嗎啉基之基；

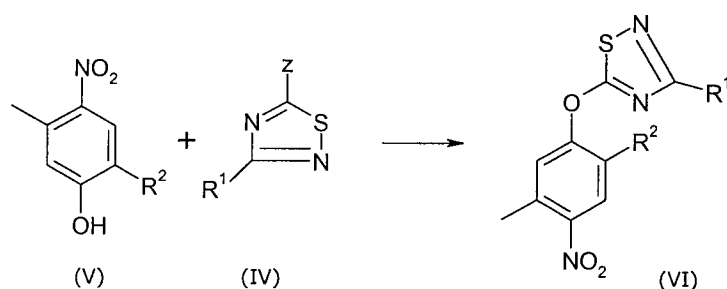
以及彼等之鹽類。

本發明之另一目標為，製備根據申請專利範圍第 1 至 4 項之噻二唑基氧苯基脒類的方法，包括至少一個下述(a)至(j)之階段步驟：

(a) 根據下述之反應圖表，令式(III)的硝基苯衍生物類與具式(II)之一種噻二唑基醇反應：

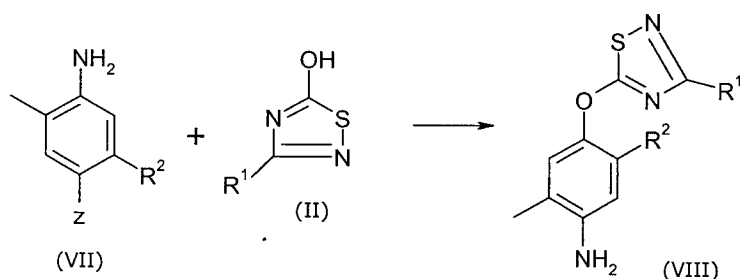


(b) 根據下述之反應圖表，令式(V)的硝基苯酚衍生物類與具式(IV)之噻二唑基衍生物類反應：

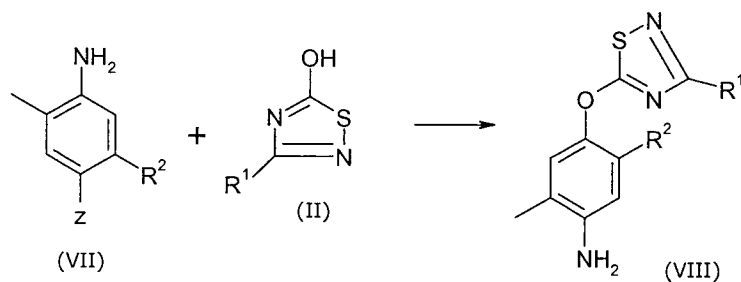


5

(c) 根據下述之反應圖表，令式(VII)的苯胺類與具式(II)之一種噻二唑基醇反應：



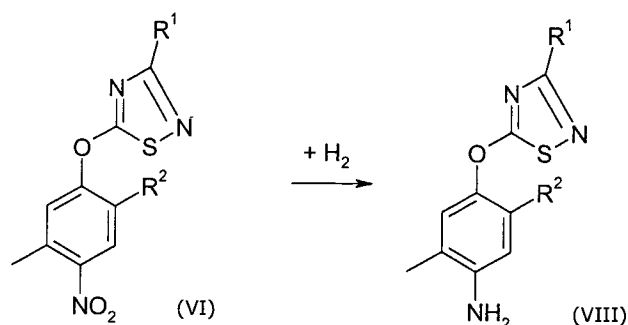
(d) 根據下述之反應圖表，令式(XII)的胺基苯酚類與具式(IV)的噻二唑基衍生物類反應：



10

(e) 根據下述之反應圖表，將式(VI)的硝基苯氧基醚類進

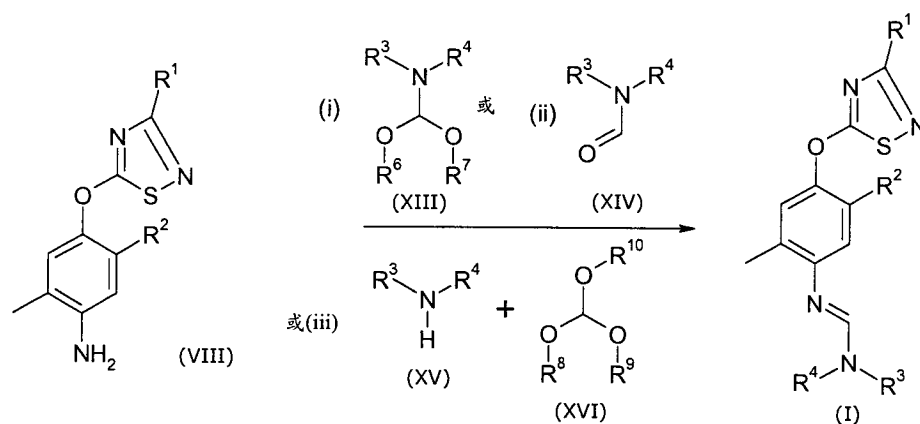
行還原反應，製得具式(VIII)之苯胺醚類：



(f) 令式(VIII)的苯胺醚類與以下的化合物

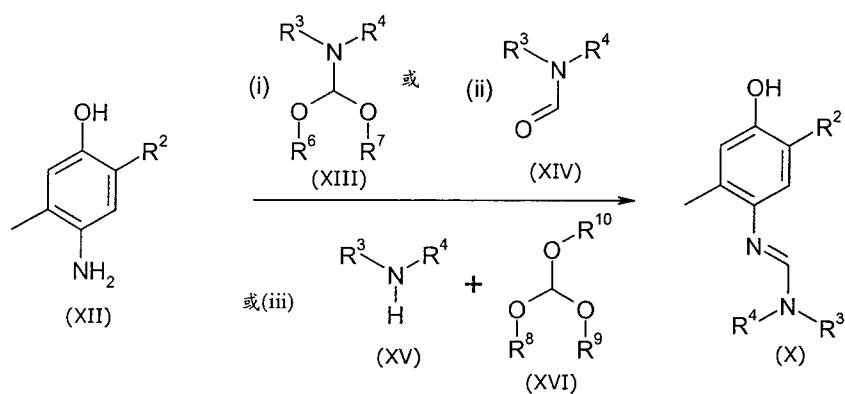
- (i) 具式(XIII)之胺基縮醛類，或
- (ii) 具式(XIV)之醯胺類，或
- (iii) 具式(XV)之胺類，在式(XVI)之正酯類 (orthoesters)存在下

根據下述之反應圖表反應：



(g) 令式(XII)的胺基苯酚類與以下的化合物

- (i) 具式(XIII)之胺基縮醛類，或
 - (ii) 具式(XIV)之醯胺類，或
 - (iii) 具式(XV)之胺類，在式(XVI)之正酯類存在下
- 根據下述之反應圖表反應：

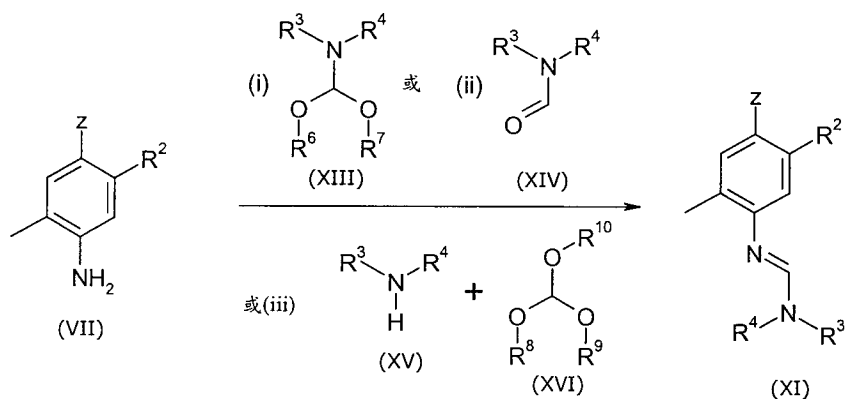


(h) 令式(VII)的胺基酚類與以下的化合物

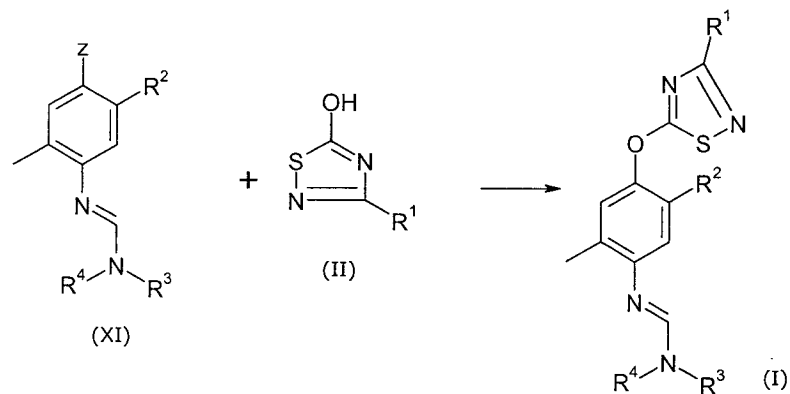
(i) 具式(XIII)之胺基縮醛類，或

(ii) 具式(XIV)之醯胺類，或

(iii) 具式(XV)之胺類，在式(XVI)之正酯類存在下
根據下述之反應圖表反應：

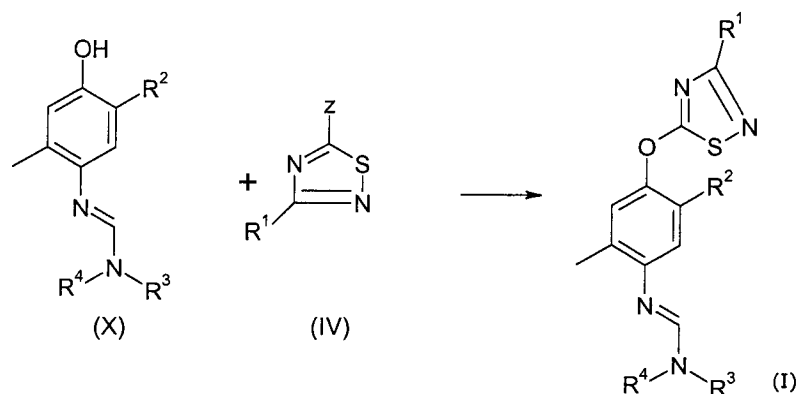


(i) 根據下述之反應圖表，令式(XI)的脘類與具式(II)的噻二唑基醇反應：



(j) 根據下述之反應圖表，令式(XI)的脘類與具式(IV)的

噻二唑基衍生物類反應：



其中，於上述圖表中，

Z 為一種脫離基；

R¹ 至 R⁴ 具有前述之定義；

且

R⁶ 及 R⁷ 彼此獨立地為挑選自包括下述之基：氫、C₁₋₁₂-烷基、C₂₋₁₂-烯基、C₂₋₁₂-炔基、C₅₋₁₈-芳基及 C₇₋₁₉-芳基烷基，且可與彼等被附接的原子一起形成一種 5-、6-或 7-成員的環；

R⁸ 至 R¹⁰ 彼此獨立地為挑選自包括下述基：氫、C₁₋₁₂-烷基、C₂₋₁₂-烯基、C₂₋₁₂-炔基、C₅₋₁₈-芳基、C₇₋₁₉-芳基-烷基及 C₇₋₁₉-烷基芳基，且各情形下，R¹⁰ 與 R¹²、R¹⁰ 與 R¹¹ 或 R¹¹ 與 R¹² 可一起與彼等被附接的原子且適當的與另外的碳、氮、氧或硫原子，形成一種 5-、6-或 7-成員的環。

本發明之第三個目標為，根據本發明之噻二唑基氧苯基脒類或其混合物，用於對抗不想要的微生物之用途。

本發明之第四個目標為，一種用於對抗不想要的微生

物之組成物，係包含至少一種根據本發明之噻二唑基氧苯基脒。

本發明之另一目標為一種用於對抗不想要的微生物之方法，特徵為，將根據本發明之噻二唑基氧苯基脒類施加至微生物及/或其生活環境。

此外，本發明關於已被至少一種根據本發明之脒類處理之種子。

最後一點，本發明關於藉由使用經至少一種根據本發明之噻二唑基氧苯基脒處理的種子，用於保護種子，免於不想要的微生物攻擊之一種方法。

一般定義

在本發明中，所稱之鹵素(X)包含，除非另有定義，係指挑選自包括氟、氯、溴及碘之物，較佳者係使用氟、氯及溴，又以使用氟及氯為最佳。

適當地經取代的基可以是單-或多-取代的，在多取代的情況下，取代基有可能相同或不同。

經一或多個鹵素原子取代的(-X)烷基被挑選自，例如，三氟甲基(CF₃)、二氟甲基(CHF₂)、CF₃CH₂、ClCH₂、CF₃CCl₂及 CHF₂CCl₂。

本發明中，除非另有定義，烷基被定義成：一種線形的、支鏈形的或環形烴基，其可選擇地包含 1、2 或多個挑選自氧、氮、磷及硫之雜原子，此外，根據本發明的烷基可選擇地經取代另外的挑選自下述之基：-R'、鹵素(-X)、

烷氧基(-OR')、硫醚或氫硫基(-SR')、胺基(-NR'₂)、矽烷基(-SiR'₃)、羧基(-COOR')、氰基(-CN)、醯基(-(C=O)R')及醯胺基(-CONR'₂)之基，R'為氫或一種 C₁₋₁₂-烷基，較佳地為一種 C₂₋₁₀-烷基，特別佳地為一種 C₃₋₈-烷基，其可包含一或多個挑選自氮、氧、磷及硫之雜原子。

C₁-C₁₂-烷基之定義包含在此被定義之最大範圍的烷基，明確地，此定義包含，例如，甲基、乙基、正丙基、異丙基、正丁基、異丁基、第二-丁基及第三-丁基、正戊基、正己基、1,3-二甲基丁基、3,3-二甲基丁基、正庚基、正壬基、正癸基、正十一烷基及正十二烷基。

環形 C₃₋₁₂-烷基之定義包含在此被定義之最大範圍之環烷基，明確地，此定義包含，例如，環丙基、環丁基、環戊基、環己基、環庚基及環辛基。

本發明中，除非另有定義，烯基被定義成：一種線形的、支鏈形的或環形烴基，其包含至少一個單不飽和鍵(雙鍵)且可選擇地包含 1、2 或多個的單或雙個不飽和鍵或 1、2 或多個挑選自氧、氮、磷及硫之雜原子，此外，根據本發明的烯基可選擇地經取代另外地挑選自下述之基：-R'、鹵素(-X)、烷氧基(-OR')、硫醚或氫硫基(-SR')、胺基(-NR'₂)、矽烷基(-SiR'₃)、羧基(-COOR')、氰基(-CN)、醯基(-(C=O)R')及醯胺基(-CONR'₂)之基，R'為氫或一種 C₁₋₁₂-烷基，較佳地為一種 C₂₋₁₀-烷基，特別佳地為一種 C₃₋₈-烷基，其可包含一或多個挑選自氮、氧、磷及硫之雜原子。

C₂-C₁₂-烯基包含在此被定義之最大範圍的一種烯基，

明確地，此定義包含，例如，乙烯基；烯丙基(2-丙烯基)、異丙烯基(1-甲基乙烯基)；丁-1-烯基(巴豆基)、丁-2-烯基、丁-3-烯基；己-1-烯基、己-2-烯基、己-3-烯基、己-4-烯基、己-5-烯基；庚-1-烯基、庚-2-烯基、庚-3-烯基、庚-4-烯基、庚-5-烯基、庚-6-烯基；辛-1-烯基、辛-2-烯基、辛-3-烯基、辛-4-烯基、辛-5-烯基、辛-6-烯基、辛-7-烯基；壬-1-烯基、壬-2-烯基、壬-3-烯基、壬-4-烯基、壬-5-烯基、壬-6-烯基、壬-7-烯基、壬-8-烯基；癸-1-烯基、癸-2-烯基、癸-3-烯基、癸-4-烯基、癸-5-烯基、癸-6-烯基、癸-7-烯基、癸-8-烯基、癸-9-烯基；十一碳-1-烯基、十一碳-2-烯基、十一碳-3-烯基、十一碳-4-烯基、十一碳-5-烯基、十一碳-6-烯基、十一碳-7-烯基、十一碳-8-烯基、十一碳-9-烯基、十一碳-10-烯基；十二碳-1-烯基、十二碳-2-烯基、十二碳-3-烯基、十二碳-4-烯基、十二碳-5-烯基、十二碳-6-烯基、十二碳-7-烯基、十二碳-8-烯基、十二碳-9-烯基、十二碳-10-烯基、十二碳-11-烯基；丁-1,3-二烯基、戊-1,3-二烯基。

本發明中，除非另有定義，炔基被定義成：一種線形的、支鏈形的或環形烴基，其包含至少一個雙不飽和鍵(三鍵)且可選擇地包含1、2或多個的單或雙個不飽和鍵或1、2或多個挑選自氧、氮、磷及硫之雜原子，此外，根據本發明的炔基可選擇地經取代另外的挑選自下述之基：-R'、鹵素(-X)、烷氧基(-OR')、硫醚或氫硫基(-SR')、胺基(-NR'₂)、矽烷基(-SiR'₃)、羧基(-COOR')、氰基(-CN)、鹽基(-(C=O)R')及鹽胺基(-CONR'₂)之基，R'為氫或一種線型的、分枝的或

環形的 C_{1-12} -烷基，其可包含一或多個挑選自氮、氧、磷及硫之雜原子。

C_2-C_{12} -炔基包含在此被定義之最大範圍的一種炔基，明確地，此定義包含，例如，乙炔基(乙炔)；丙-1-炔基及丙-2-炔基。

本發明中之芳基為，除非另有定義，係指芳族的烴基，其可包含 1、2 或多個挑選自氮、氧、磷及硫之雜原子且可選擇地經取代另外挑選自下述之取代基： $-R'$ 、鹵素($-X$)、烷氧基($-OR'$)、硫醚或氫硫基($-SR'$)、胺基($-NR'_2$)、矽烷基($-SiR'_3$)、羧基($-COOR'$)、氰基($-CN$)、醯基($-(C=O)R'$)及醯胺基($-CONR'_2$)之基， R' 為氫或一種 C_{1-12} -烷基，較佳地為一種 C_{2-10} -烷基，特別佳地為一種 C_{3-8} -烷基，其可包含一或多個挑選自氮、氧、磷及硫之雜原子。

C_5-C_{18} -芳基包含在此被定義之最大範圍的一種具 5 至 18 個原子之芳基，明確地，此定義包含，例如，環戊二烯基、苯基、環庚三烯基、環辛四烯基、萘基及蒽基。

包含 1、2 或多個挑選自氮、氧、磷及硫之雜原子的 C_5-C_{18} -芳基為挑選自包括，例如下述基：2-呋喃基、3-呋喃基、2-噻吩基、3-噻吩基、2-吡咯基、3-吡咯基、3-異噁唑基、4-異噁唑基、5-異噁唑基、3-異噻唑基、4-異噻唑基、5-異噻唑基、3-吡唑基、4-吡唑基、5-吡唑基、2-噁唑基、4-噁唑基、5-噁唑基、2-噻唑基、4-噻唑基、5-噻唑基、2-咪唑基、4-咪唑基、1,2,4-噁二唑-3-基、1,2,4-噁二唑-5-基、1,2,4-噻二唑-3-基、1,2,4-噻二唑-5-基、1,2,4-三唑-3-基、

1,3,4-噁二唑-2-基、1,3,4-噻二唑-2-基以及 1,3,4-三唑-2-基；
 1-吡咯基、1-吡唑基、1,2,4-三唑-1-基、1-咪唑基、1,2,3-三
 唑-1-基、1,3,4-三唑-1-基、3-噻吡基、4-噻吡基、2-嘧啶基、
 4-嘧啶基、5-嘧啶基、2-吡嗪基、1,3,5-三吡-2-基及 1,2,4-
 三吡-3-基。

芳基烷基(芳烷基)在本發明中，除非另有說明，係指經
 芳基取代之烷基，其可包含一種 C_{1-8} -亞烷基鏈及可在芳基
 骨架或亞烷基鏈上經取代一或多個挑選自氮、氧、磷及硫
 之雜原子及選擇地挑選自下述之另外的基： $-R'$ 、鹵素($-X$)、
 烷氧基($-OR'$)、硫醚或氫硫基($-SR'$)、胺基($-NR'_2$)、矽烷基
 ($-SiR'_3$)、羧基($-COOR'$)、氰基($-CN$)、醯基($-(C=O)R'$)及醯
 胺基($-CONR'_2$)之基， R' 為氫或一種 C_{1-12} -烷基，較佳地為一
 種 C_{2-10} -烷基，特別佳地為一種 C_{3-8} -烷基，其可包含一或多
 個挑選自氮、氧、磷及硫之雜原子。

C_{7-19} -芳烷基包含在此被定義之最大範圍的一種具總數
 為 7 至 19 個原子於骨架及亞烷基鏈之芳基烷基，較佳者係
 那些包含 5 或 6 個碳原子或雜原子於芳基骨架及 1 至 8 個
 碳原子於亞烷基鏈之那些 C_{7-19} 芳烷基，明確地，此定義包
 含，例如，苯甲基及苯乙基。

烷基芳基(烷芳基)在本發明中，除非另有說明，係指經
 烷基取代之芳基，其可包含一種 C_{1-8} -亞烷基鏈及可在芳基
 骨架或亞烷基鏈上經取代一或多個挑選自氮、氧、磷及硫
 之雜原子及選擇地挑選自下述之另外的基： $-R'$ 、鹵素($-X$)、
 烷氧基($-OR'$)、硫醚或氫硫基($-SR'$)、胺基($-NR'_2$)、矽烷基

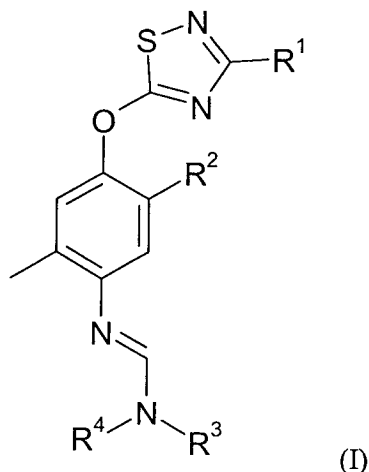
(-SiR'₃)、羧基(-COOR')、氰基(-CN)、鹽基(-(C=O)R')及醯胺基(-CONR'₂)之基，R'為氫或一種 C₁₋₁₂-烷基，較佳地為一種 C₂₋₁₀-烷基，特別佳地為一種 C₃₋₈-烷基，其可包含一或多個挑選自氮、氧、磷及硫之雜原子。

5 C₇₋₁₉-烷基芳基包含在此被定義之最大範圍的一種具總數 7 至 19 個原子於骨架及亞烷基鏈之一種烷芳基，較佳者係那些包含 5 或 6 個碳原子或雜原子於芳基骨架及 1 至 8 個碳原子於亞烷基鏈之那些 C₇₋₁₉ 芳烷基，明確地，此定義包含，例如，甲基-、2,3-、2,4-、2,5-、2,6-、3,4-或 3,5-
10 二甲基苯基。

此烷基、烯基、炔基、芳基、烷基芳基及芳烷基可再包含 1 或多個雜原子，除非另被定義，係挑選自氮、氧、磷及硫，此雜原子係置換所示之碳原子。

根據本發明之化合物，可以呈現由不同的可能異構物
15 (特別是立體異構物)所成混合物型式存在，例如，E-及 Z-異構物、蘇(threo-)及赤(erythro-)異構物、及光學異構物，但，適當的，也包括互變異構物；兩者 E-及 Z-異構物，以及蘇及赤異構物、及光學異構物、這些異構物之任一種混合物、以及可能的互變異構物均為被擄露及被主張者。

20 根據本發明之脘類為具式(I)之化合物



或其鹽類、N-氧化物類及金屬複合物及其立體異構物類。

在式(I)中，各基具有被定義如後之意義，定義同樣適用於所有中間物中之基：

R^1 為第三-丁基；

R^2 為挑選自包括甲基、 C_{1-6} -鹵基烷基及鹵素之基；

R^3 為 C_{1-8} -烷基；

R^4 為挑選自包括乙基及異丙基之基。

根據本發明之另一具體實施例中， R^3 及 R^4 與彼等被附接的氮原子可一起形成一種六氫吡啶基、吡咯啶基或 2,6-二甲基嗎啉基之基。

在式(I)中，較佳的化合物具有被定義如後之基，其定義同樣適用於所有較佳的中間物：

R^1 較佳地為第三-丁基；

R^2 較佳地為挑選自甲基、氯及三氟甲基；

R^3 較佳地為甲基；

R^4 較佳地為乙基。

根據本發明之另一較佳的具體實施例中， R^3 及 R^4 與彼等被附接的氮原子或與挑選自氮、氧、磷及硫之另外的原

子，可一起形成一種 5-或 6-成員的環，其可經 C_{1-12} -烷基之基取代，較佳地為一種 C_{2-10} -烷基，特別佳地為一種 C_{3-8} -烷基。

式(I)中，具有特別佳含義之基被定義如下，其也適用於特別佳的中間物中之定義：

R^1 特別佳地為第三-丁基；

R^2 特別佳地為挑選自甲基及三氟甲基；

R^3 特別佳地為甲基；

R^4 特別佳地為乙基。

根據本發明之另一特別佳的具體實施例中， R^4 及 R^3 與彼等被附接的氮原子可一起形成一種六氫吡啶基環。

視上述被定義之取代基的類型，呈現酸性或鹼性性質之式(I)化合物，可與無機或有機酸或與鹼或與金屬離子形成鹽類，適當的，也可形成內鹽或加合物。

適當的金屬離子為，特別是第 2 主族元素之離子，特別是鈣與鎂，第 3 及第 4 主族元素之離子，特別是鋁、錫及鉛，以及第 1 至第 8 副族之離子，特別是鉻、錳、鐵、鈷、鎳、銅、鋅等，特別佳的為第 4 週期之元素的離子，就此而論，這些金屬可以適於它們之化學價存在。

如果式(I)的化合物攜帶羥基、羧基或其他可誘發酸性性質之基時，這些化合物可與鹼類反應以製得鹽類。

適當的鹼類為，例如，鹼或鹼土金屬之氫氧化物、碳酸鹽類或碳酸氫鹽類，特別是那些鈉、鉀、鎂及鈣，以及胺、與(C_1 - C_4)烷基形成之一級、二級及三級胺類、(C_1 - C_4)-

烷醇類之單-、二-及三烷醇胺類、膽鹼及氯膽鹼。

如果式(I)的化合物攜帶胺基、烷基胺基或其他可誘發鹼性性質之基時，這些化合物可與酸類反應製得鹽類。

無機酸類的實例為鹵化酸類，例如，氟化氫、氯化氫、
5 溴化氫及碘化氫、硫酸、磷酸及硝酸及酸性鹽類，例如 NaHSO_4 及 KHSO_4 。

適當的有機酸類為，例如，甲酸、碳酸、及烷酸類，
例如，乙酸、三氟乙酸、三氯乙酸及丙酸，以及羥基乙酸、
硫氰酸、乳酸、琥珀酸、檸檬酸、苯甲酸、肉桂酸、草酸、
10 烷基磺酸類(帶有具 1 至 20 個碳原子之直鏈或支鏈烷基的磺
酸)、芳基磺酸類或芳基二磺酸類(攜帶一或二個磺酸基團之
芳基類，例如苯基及萘基)、烷基膦酸類(帶有具 1 至 20 個
碳原子之直鏈或支鏈烷基的膦酸類)以及芳基膦酸或芳基二
膦酸類(攜帶 1 或 2 個磷酸基之芳族基，例如，苯基及萘基)，
15 也有可能在烷基或芳基上再攜帶另外的取代基，例如，對-
甲苯磺酸、水楊酸、對-胺基水楊酸、2-苯氧基苯甲酸、2-
乙酸基苯甲酸，等等。

如此製得的鹽類，同樣地呈現殺真菌的性質。

就本發明而言，特別佳地，脘類係挑選自包括下列化
20 合物：

- (A-1) N' -{4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噁二唑-5-基)氧]-2,5-二
甲基苯基}-N-乙基-N-甲基-亞脘胺基甲脘胺；
(A-2) N' -{4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噁二唑-5-基)氧]-2,5-二
甲基苯基}-N-異丙基-N-甲基亞脘胺基甲脘胺；

(A-3) 4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-2,5-二甲基
-N-[(1E)-六氫吡啶-1-基亞甲基]苯胺；

(A-4) 4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-2-甲基
-N-[(1E)-六氫吡啶-1-基亞甲基]-5-(三氟甲基)苯胺；

5 (A-5) N'-{4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-2-甲基
-5-(三氟甲基)苯基}-N-乙基-N-甲基-亞醯胺基甲醯
胺；

(A-6) N'-{4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-2-甲基
-5-(三氟-甲基)苯基}-N-異丙基-N-甲基亞醯胺基甲
10 醯胺；

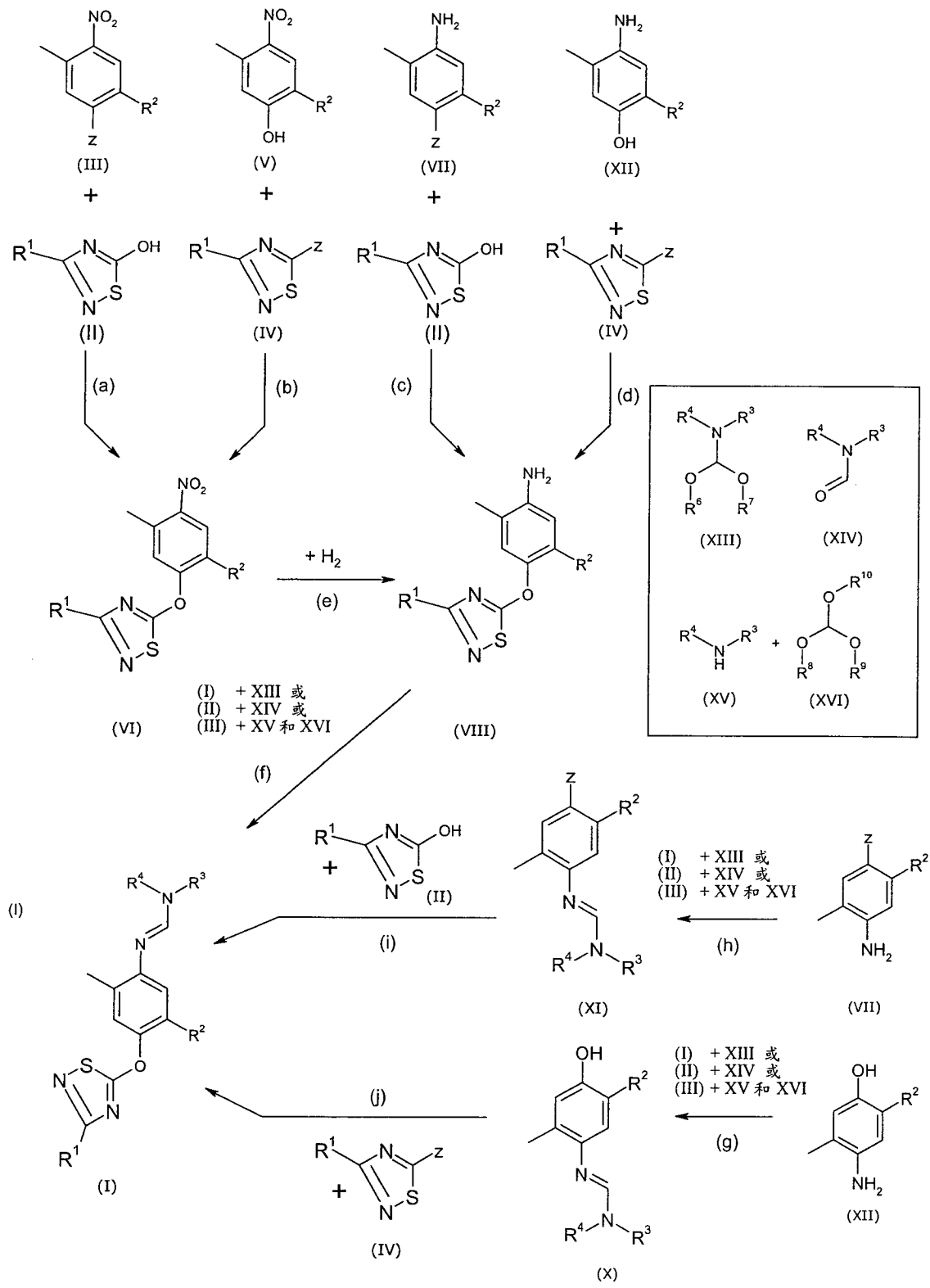
(A-7) N'-{4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-5-氯-2-
甲基苯基}-N-異丙基-N-甲基亞醯胺基甲醯胺；

(A-8) N'-{4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-5-氯-2-
甲基苯基}-N-乙基-N-甲基-亞醯胺基甲醯胺；

15 (A-9) 4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-5-氯-2-甲
基-N-[(1E)-六氫吡啶-1-基亞甲基]苯胺。

根據本發明之脘類的製備

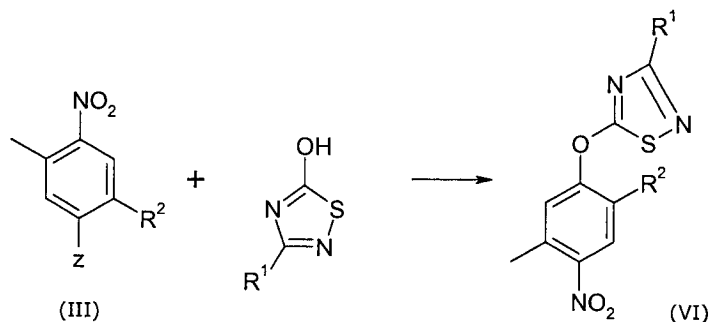
根據本發明之脘類可利用下面圖表(I)中代表之方法被
20 製備：



圖表(I)

階段步驟(a)

根據本發明的一具體實施例中，式(III)之硝基苯衍生物類被與式(II)之噻二唑基醇類或由之形成之烷氧化物類，根據下述的反應圖表進行，製得式(VI)之硝基苯基醚類：



在主要的反應條件下，呈現一種良好的釋離性 (nucleofugality) 之所有取代基為適於作為脫離基者，可被提及者為，例如，鹵素、三氟甲磺酸鹽、甲磺酸鹽、甲苯磺酸鹽或 SO_2Me 。

此反應宜在一種鹼存在下進行。

反應較佳地在一種鹼存在下進行，適當的鹼類為通常被使用於這類反應之有機及無機鹼類，較佳的鹼類係使用，例如，挑選自包括鹼金屬或鹼土金屬之氫化物類、氫氧化物類、鹽胺化物、醇化物、乙酸鹽類、氟化物類、磷酸鹽類、碳酸鹽類及碳酸氫鹽類，特別佳者為鹽胺化鈉、氫化鈉、二異丙基鹽胺化鋰、甲醇鈉、第三-丁氧基鉀、氫氧化鈉、氫氧化鉀、乙酸鈉、磷酸鈉、磷酸鉀、氟化鉀、氟化鈉、碳酸鈉、碳酸鉀、碳酸氫鉀、碳酸氫鈉及碳酸鈉，此外為，三級胺類，例如，三甲基胺、三乙基胺、三丁基胺、N,N-二甲基苯胺、N,N-二甲基苯基胺、吡啶、N-甲基六氫吡啶、N-甲基吡咯啶、N,N-二甲基胺基吡啶、二氮

雜雙環辛烷(DABCO)、二氮雜雙環壬烯(DBN)及二氮雜雙環十一碳烯(DBU)。

適當的，可使用選自包括下述之一種催化劑：鈰、銅及其鹽類或複合物。

5 硝基苯衍生物與苯酚之反應可直接地進行或在一種溶劑內進行；較佳地係選用在主要的反應條件下，不會參與反應之一種標準溶劑內進行。

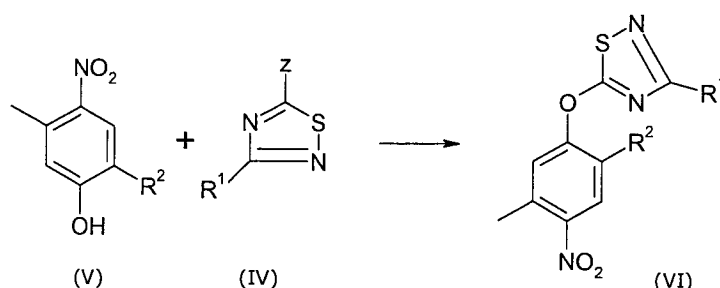
較佳者係使用脂肪族的、脂環族的或芳族的烴類，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲
10 苯、二甲苯或十氫萘；鹵化的烴類，例如，氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚類，例如，二乙基醚、二異丙基醚、甲基第三-丁基醚(MTBE)、甲基第三-戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚；腈類，例如，乙腈、丙腈、正
15 -丁腈、異丁腈或苯甲腈；醯胺類，例如，N,N-二甲基甲醯胺(DMF)、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲苯胺、N-甲基吡咯酮(NMP)或六甲基磷醯胺；或這些與水之混合物，以及也包括純水。

反應可在真空下、在標準壓力或在加壓下、及在-20至
20 200°C的溫度下進行；較佳地，反應係在標準的壓力及自50至150°C的溫度下進行。

階段步驟(b)

根據本發明的另一具體實施例中，式(V)之硝基硝基苯

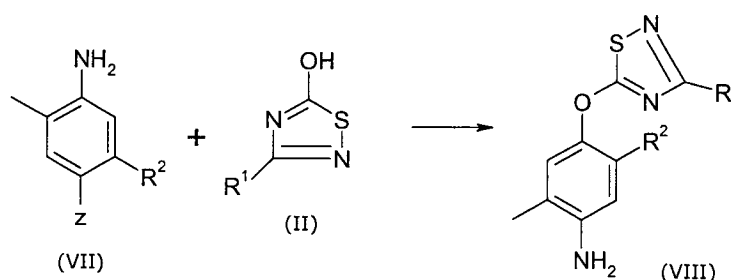
酚衍生物類或由之形成之苯氧化物類，被與式(IV)之噻二唑基衍生物類，根據下述的反應圖表反應，製得式(VI)之硝基苯基醚類(VI)：



至於其中之反應條件、溶劑、催化劑及適當的脫離基，可參考階段步驟(a)中之用法。

階段步驟(c)

根據本發明的又一具體實施例中，式(VII)之苯胺類被與式(II)之噻二唑基醇類或由之形成之烷氧化物類，根據下述的反應圖表反應，製得式(VIII)之胺基苯基醚類：

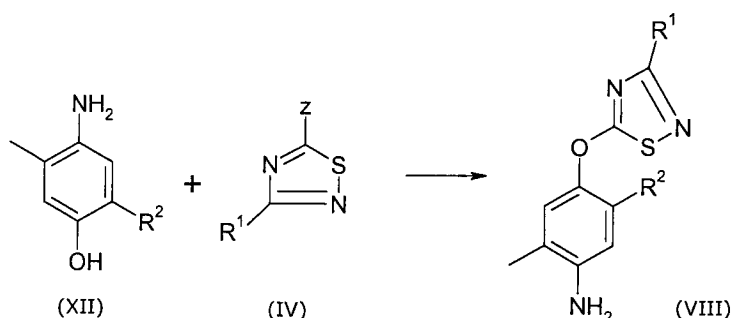


至於其中之反應條件、溶劑、催化劑及適當的脫離基，可參考階段步驟(a)中之用法。

階段步驟(d)

根據本發明的又一具體實施例中，式(XII)之胺基苯酚類被與式(IV)之噻二唑基衍生物類，根據下述的反應圖表反

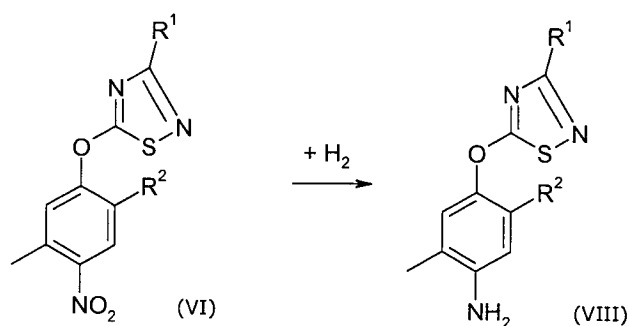
應，製得式(VIII)之胺基苯基醚類：



至於其中之反應條件、溶劑、催化劑及適當的脫離基，可參考階段步驟(a)及階段步驟(c)中之用法。

階段步驟(e)

在階段步驟(a)及(b)中製得之式(VI)之硝基苯基醚類，可根據下述的反應圖表進行還原反應，製得式(VIII)之苯胺醚類：



根據階段步驟(e)之還原反應，可使用文獻中供進行還原硝基之所有方法進行。

此還原反應宜採用描述於 WO-A-O 046 184 中之方法，與在濃鹽酸中的氯化錫反應，或者，此反應也可使用氫氣、在適當的氫化催化劑(例如，阮來鎳(Raney nickel)或Pd/C)存在下進行，反應的條件可採用先前文獻中所載的方式，其為本技藝的行家所熟悉者。

如果反應係呈液相進行，其係在主要的反應條件下不會參與反應的溶劑內進行，例如，在甲苯內反應。

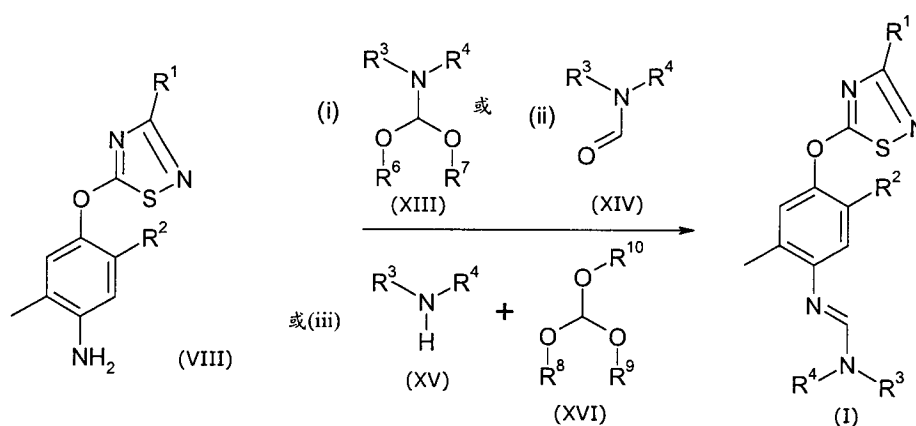
階段步驟(f)

根據階段步驟(f)，由式(VIII)的苯胺醚類製取根據本發明的式(I)之脘類的反應，可如上面圖表(I)中，根據不同的替代過程，使用下述化合物

(i) 式(XIII)之胺基縮醛類，或

(ii) 式(XIV)的醯胺類，或

(iii) 式(XV)之胺類，在式(XVI)的正酯類存在下，
根據下述的反應圖表進行反應：



根據本發明的個別的替代之具體實施例(i)至(iii)過程，被簡短地說明如下：

(i) 根據本發明之一具體實施例，圖表(I)中以階段步驟(i)代表者，係令式(VIII)的苯胺醚類與式(VIII)的胺基縮醛類反應，其中 R³ 及 R⁴ 被定義如前且 R⁶ 及 R⁷ 為挑選自 C₁₋₈-烷基，較佳地為挑選自 C₂₋₆-烷基，特別佳地為

挑選自 C_{3-5} -烷基，且可與彼等被附接的氧原子一起形成一種 5-或 6-成員的環，製得根據本發明之具式(I)之噻二唑基氧苯基脒類。

式(XIII)的胺基縮醛類可得自被描述於 JACS, 65, 1566 (1943)中之甲醯胺類，藉由與烷化劑(例如，二甲基硫酸酯)反應而得。

根據階段步驟(i)之反應，宜在一種酸存在下進行。

適當的酸類為，例如，挑選自包括下述之有機及無機酸類：對-甲苯磺酸、甲磺酸、鹽酸(氣態、水溶液或在有機溶液內)或硫酸。

(ii) 另一根據本發明之替代的具體實施例中，在圖表(I)中以階段步驟(ii)代表者，係令式(VIII)之苯胺醚類與式(XIV)之醯胺類反應，其中 R^3 及 R^4 基之定義如前，製得根據本發明之噻二唑基氧苯基脒類。

根據階段步驟(ii)的反應，適當的，係在一種鹵化劑存在下進行，適當的鹵化劑為，例如，挑選自包括 PCl_5 、 PCl_3 、 $POCl_3$ 或 $SOCl_2$ 之化合物。

此外，反應也可在一種偶合劑存在下進行。

適當的偶合劑為那些通常被使用於連結醯胺鍵者；可被提及者為，例如，形成酸鹵化物之化合物類，例如，光氣、三溴化磷、三氯化磷、五氯化磷、磷醯氯或硫醯氯；形成酸酐類之化合物類，例如，氯甲酸酯、氯甲酸甲酯、氯甲酸異丙酯、氯甲酸異丁基酯或甲磺醯基氯；碳二亞醯胺類，例如，N,N'-二環己基碳

二亞醯胺(DCC)、或其他標準的偶合劑，例如，五氧化二磷、聚磷酸、N,N'-碳二咪唑、2-乙氧基-N-乙氧基羰基-1,2-二氫喹啉(EEDQ)、三苯基磷/四氯甲烷或溴三吡咯啶基磷六氟磷酸鹽。

5 根據階段步驟(ii)的反應宜在一種溶劑內進行，其為挑選自對主要的反應條件為惰性之一般溶劑，較佳者係使用脂肪族的、脂環族的或芳族的烴類，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；鹵化的烴類，例如，氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚類，例如，二乙基醚、二異丙基醚、甲基第三-丁基醚(MTBE)、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；腈類，例如，乙腈、丙腈、正-丁腈、異丁腈、或
10 苯甲腈；醯胺類，例如，N,N-二甲基甲醯胺(DMF)、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲苯胺、N-甲基吡咯酮(NMP)或六甲基磷醯胺；酯類，例如，乙酸甲酯或乙酸乙酯；亞砜類，例如，二甲亞砜(DMSO)；砜類，例如，環砜烷；醇類，例如，甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第二-丁醇、第三-丁醇、乙
15 二醇、1,2-丙二醇、乙氧基乙醇、甲氧基乙醇、二乙二醇單甲基醚、二乙二醇單乙基醚或這些化合物之混合物。

20 (iii) 根據本發明之另一替代的具體實施例，在圖表(I)中以

階段步驟(iii)代表者，係令式(VII)的苯胺醚類與式(XV)之胺類反應，其中 R^3 及 R^4 基之定義如前，在式(XVI)的正酯類存在下進行，其中 R^1 為氫且 R^8 至 R^{10} 為彼此獨立地挑選自： C_{1-8} -烷基，較佳地為 C_{2-6} -烷基，特別佳地為 C_{3-5} -烷基，且可與彼等被附接的氧原子一起形成一種 5-或 6-成員的環，製得根據本發明之噻二唑基氧苯基脒類。

根據階段步驟(iii)的反應宜在一種溶劑內進行，可挑選在主要的反應條件下不會參與反應之一的溶劑類，較佳者係使用脂肪族的、脂環族的或芳族的烴類，例如，石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或十氫萘；鹵化的烴類，例如，氯苯、二氯苯、二氯甲烷、氯仿、四氯化碳、二氯乙烷或三氯乙烷；醚類，例如，二乙基醚、二異丙基醚、甲基第三-丁基醚(MTBE)、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；腈類，例如，乙腈、丙腈、正-丁腈、異丁腈、或苯甲腈；醯胺類，例如，N,N-二甲基甲醯胺(DMF)、N,N-二甲基乙醯胺、N-甲基甲苯胺、N-甲基吡咯酮(NMP)或六甲基磷醯胺；酯類，例如，乙酸甲酯或乙酸乙酯；亞砜類，例如，二甲亞砜(DMSO)；砜類，例如，環砜烷；醇類，例如，甲醇、乙醇、正丙醇、異丙醇、正丁醇、異丁醇、第二-丁醇、第三-丁醇、乙二醇、1,2-丙二醇、乙氧基乙醇、甲氧基乙醇、二乙二

醇單甲基醚、二乙二醇單乙基醚；或這些化合物與水之混合物，以及包括使用純水。

階段步驟(g)

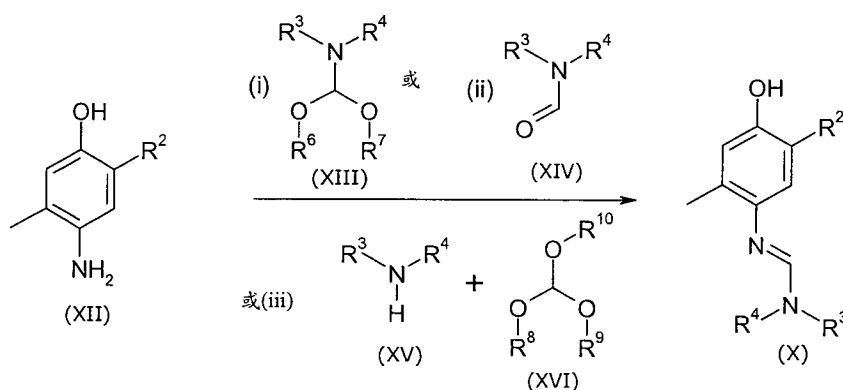
根據本發明之另一具體實施例中，式(XII)之胺基苯酚類甚至可與下述化合物

(i) 式(XIII)之胺基縮醛類，或

(ii) 式(XIV)的醯胺類，或

(iii) 式(XV)之胺類，在式(XVI)的正酯類存在下，

根據下述的反應圖表反應，製得式(X)之脒類：



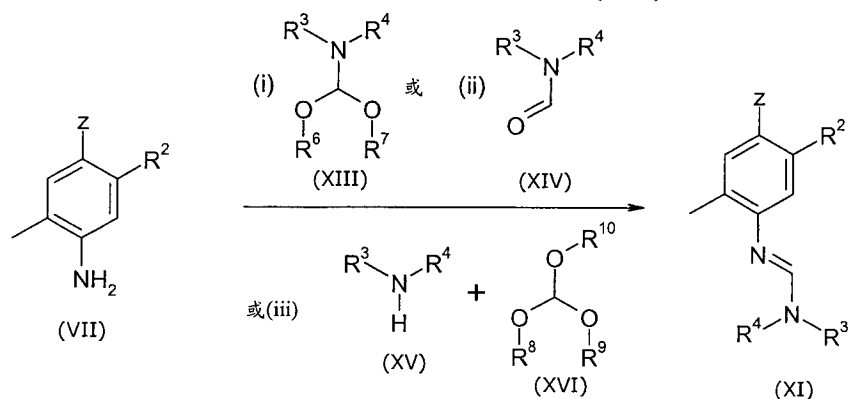
至於反應的條件、使用的溶劑及催化劑，可參考階段步驟(f)中之方式。

另外，式(X)的脒類製取根據本發明的式(I)之目標化合物之另外的反應可根據，例如，描述於階段步驟(j)中之方法進行。

階段步驟(h)

根據本發明之另一具體實施例中，式(VII)之胺基苯基衍生物類可與下述化合物

- (i) 式(XIII)之胺基縮醛類，或
 (ii) 式(XIV)的醯胺類，或
 (iii) 式(XV)之胺類，在式(XVI)的正酯類存在下，
 根據下述的反應圖表反應，製得式(XI)之脒類：

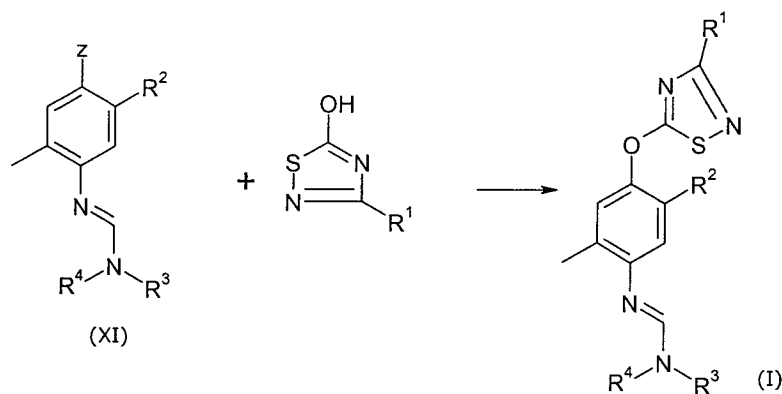


當中所用的反應條件、溶劑及催化劑，可參考被說明於階段步驟(f)中者。

進一步令式(XI)的脒類反應以製取根據本發明的式(I)之目標分子之反應，可利用，例如，階段步驟(i)中描述的方法進行。

階段步驟(i)

根據本發明之另外的具體實施例，可得自階段步驟(h)之具式(XI)之脒類，可根據下述的反應圖表，令其與噻二唑基醇類或由其形成之烷氧化物類反應，製得根據本發明之具式(I)之目標化合物：

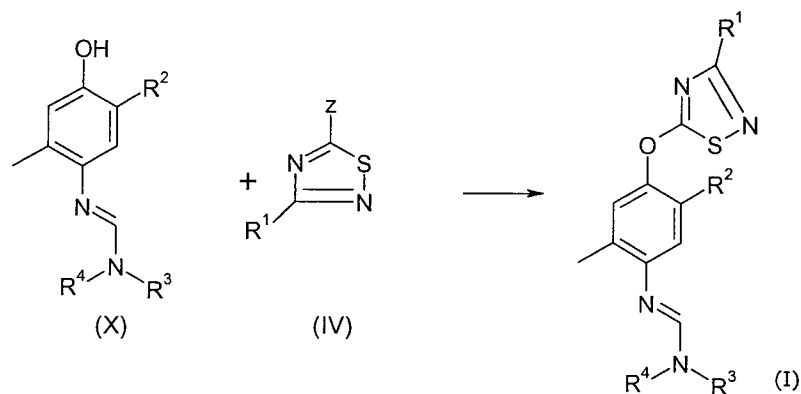


至於其中的反應條件、溶劑及催化劑，可參考被說明於階段步驟(f)中之方式。

5

階段步驟(j)

根據本發明之另外的具體實施例，可得自階段步驟(g)之具式(X)之脘類，可根據下述的反應圖表，令其與具式(IV)之噻二唑基衍生物類反應，製得根據本發明之具式(I)之目標化合物：



10

至於其中的反應條件、溶劑及催化劑，可參考被說明於階段步驟(f)以及表 I 及 II 中之方式。

有關根據本發明用於製備式(I)的脘類之各方法，下述反應階段步驟之組合，被認為係有利的方式：階段步驟(a)、(e)及(f)；階段步驟(b)、(e)及(f)；階段步驟(c)及(f)；階段步

15

驟(d)及(f)；階段步驟(h)及(i)及/或階段步驟(g)及(j)。

根據本發明之噻二唑基氧苯基脒類的製備，適當的，沒有將中間物分離的中間步驟。

最後的純化噻二唑基氧苯基脒類之過程，可適當的藉由一般的純化方法進行，較佳地係進行結晶之方式。

對抗不想要的微生物類 Combating of undesirable microorganisms)

根據本發明的脒類呈現一種強烈的殺微生物之作用且可被使用供對抗不想要的微生物，像是真菌及細菌；用於植物保護及材料保護。

植物保護(Plant protection)

殺真菌劑類可被使用於植物保護，供對抗根腫菌(Plasmodiophoromycetes)、卵菌(Oomycetes)、壺菌(Chytridiomycetes)、接合菌(Zygomycetes)、子囊菌(Ascomycetes)、擔子菌(Basidiomycetes)與不完全菌類(Deuteromycetes)之真菌類。

殺細菌劑類可被使用於植物保護，供對抗假單胞菌科(Pseudomonadaceae)、根瘤菌科(Rhizobiaceae)、腸道桿菌科(Enterobacteriaceae)、棒狀桿菌科(Corynebacteriaceae)及鏈球菌科(Streptomyetaceae)之細菌。

被列於上面屬名下之造成真菌與細菌性疾病之一些病原菌，可順便予以舉例說明如下，但不僅限於這一些：

造成白粉病(powdery mildew)之病原菌，例如，

布氏白粉菌屬(*Blumeria species*)，例如，大麥粉狀黴菌病原體(*Blumeria graminis*)；

單囊殼屬(*Podosphaera species*)，例如蘋果白粉病菌(*Podosphaera leucotricha*)；

5 單絲殼屬(*Sphaerotheca species*)，例如，紅豆白粉病菌(*Sphaerotheca fuliginea*)；

鉤絲殼屬(*Uncinula species*)，例如，葡萄鉤絲殼(*Uncinula necator*)；

造成銹病(rust)之病原菌，例如，

10 *Gymnosporangium* 屬，例如，杜松梨鐵銹菌(*Gymnosporangium sabinae*)；

咖啡銹病屬(*Hemileia species*)，例如，駝孢銹病菌(*Hemileia vastatrix*)；

15 銹菌屬(*Phakopsora species*)，例如，大豆銹病菌(*Phakopsora pachyrhizi*與*Phakopsora meibomiaae*)；

銹菌屬(*puccinia species*)，例如，小麥赤銹病菌(*Puccinia recondita*)；

單孢銹菌屬(*Uromyces species*)，例如，疣頂單胞銹菌(*Uromyces appendiculatus*)；

20 造成疾病之卵菌綱(*Oomycetes*)病原菌，例如

盤梗霉屬(*Bremia species*)，例如，萵苣盤梗霉(*Bremia lactucae*)；

霜霉屬(*Peronospora species*)，例如，豌豆霜霉(*Peronospora pisi*)或莖臺霜霉(*P. brassicae*)；

疫病菌屬 (*Phytophthora* species), 例如, 致病疫菌 (*Phytophthora infestans*);

露菌屬 (*Plasmopara* species), 例如, 葡萄露菌 (*Plasmopara viticola*);

5 假霜霉菌屬 (*Pseudoperonospora* species), 例如, 葎草假霜霉 (*Pseudoperonospora humuli*) 或瓜類露菌 (*Pseudoperonospora cubensis*);
腐霉菌屬 (*Pythium* species), 例如, 終極腐霉菌 (*Pythium ultimum*);

造成葉斑點病與葉枯萎之病原菌, 例如,

10 鏈格孢菌屬 (*Alternaria* species), 例如, 早疫病鏈格孢菌 (*Alternaria solani*);

褐斑病菌屬 (*Cercospora* species), 例如, 甜菜褐斑病菌 (*Cercospora beticola*);

15 星病菌屬 (*Cladosporium* species), 例如, 黃瓜黑星病菌 (*Cladosporium cucumerinum*);

孢腔菌屬 (*Cochliobolus* species), 例如禾旋孢腔菌 (*Cochliobolus sativus*) (分生孢子型: *Drechslera*, syn: 長蠕孢);

20 炭疽菌屬 (*Colletotrichum* species), 例如, 炭疽菌 (*Colletotrichum lindemuthianum*);

Cycloconium species, 例如, 孔雀斑菌 (*Cycloconium oleaginum*);

蒂腐病菌屬 (*Diaporthe* species), 例如, 柑桔黑點病菌 (*Diaporthe citri*);

柑桔瘡痂病菌屬 (*Elsinoe* species), 例如, 柑桔瘡痂病菌 (*Elsinoe fawcettii*);

炭疽菌屬 (*Gloeosporium* species), 例如, 桃炭疽菌 (*Gloeosporium laeticolor*);

5 *Glomerella* species, 例如, 葡萄晚腐菌 (*Glomerella cingulata*);

Guignardia species, 例如, 葡萄黑腐菌 (*Guignardia bidwelli*);
球腔菌屬 (*Leptosphaeria* species), 例如, 十字花科小球腔菌 (*Leptosphaeria maculans*);

10 *Magnaporthe* species, 例如, 稻瘟菌 (*Magnaporthe grisea*);
蔓枯病菌屬 (*Mycosphaerella* species), 例如, *Mycosphaerelle graminicola* 及香蕉黑條葉斑病菌 (*Mycosphaerella fijiensis*);
葉枯病菌屬 (*Phaeosphaeria* species), 例如, 小麥穎枯菌 (*Phaeosphaeria nodorum*);

15 核腔菌屬 (*Pyrenophora* species), 例如, 圓核腔菌病菌 (*Pyrenophora teres*);

葉斑病菌屬 (*Ramularia* species), 例如, *Ramularia collo-cygni*;

20 喙孢屬 (*Rhynchosporium* species), 例如, 小麥雲紋病菌 (*Rhynchosporium secalis*);

殼針孢屬 (*Septoria* species), 例如, 斑枯菌 (*Septoria apii*);
淡紅核瑚菌屬 (*Typhula* species), 例如, 小麥雪腐菌 (*Typhula incarnata*);

黑星菌屬(*Venturia species*)，例如，蘋果黑星病菌(*Venturia inaequalis*)；

造成根與莖的疾病之病原菌，例如，

伏革菌屬(*Corticium species*)，例如，*Corticium graminearum*；

5 鐮刀菌屬(*Fusarium species*)，例如，蘿蔔黃葉病菌(*Fusarium oxysporum*)；

禾頂囊殼菌屬(*Gaeumannomyces species*)，例如，小麥全蝕病菌(*Gaeumannomyces graminis*)；

10 根腐病菌屬(*Rhizoctonia species*)，例如，立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*)；

Tapesia species，例如，*Tapesia acuformis*；

黑腐菌屬(*Thielaviopsis species*)，例如，菸草根黑腐菌(*Thielaviopsis basicola*)；

15 穗與花序(包括玉米穗軸)之疾病(ear and panicle diseases)，病原菌為，例如，

鏈格孢菌屬(*Alternaria species*)，例如，鏈格孢菌諸種(*Alternaria spp.*)；

麴黴屬(*Aspergillus species*)，例如，黃麴菌(*Aspergillus flavus*)；

20 星病菌屬(*Cladosporium species*)，例如，水稻污點病菌(*Cladosporium cladosporioides*)；

麥角菌屬(*Claviceps species*)，例如，麥角病菌(*Claviceps purpurea*)；

镰孢菌屬 (*Fusarium species*)，例如，大刀镰孢 (*Fusarium culmorum*)；

赤霉菌屬 (*Gibberella species*)，例如，玉蜀黍赤霉 (*Gibberella zeae*)；

5 雪霉菌屬 (*Monographella species*)，例如，小麥雪腐病菌 (*Monographella nivalis*)；

造成黑穗病 (smuts) 之病原菌，例如，

軸黑粉菌屬 (*Sphacelotheca species*)，例如，絲軸黑粉菌 (*Sphacelotheca reiliana*)；

10 腥黑粉菌屬 (*Tilletia species*)，例如，小麥網腥黑粉菌 (*Tilletia caries*)；

條黑粉菌屬 (*Urocystis species*)，例如，*Urocystis occulta*；

黑穗菌屬 (*Ustilago species*)，例如，*Ustilago nuda*；

水果腐壞 (fruit rot) 之病原菌，例如，

15 麴霉屬 (*Aspergillus species*)，例如，黃麴菌 (*Aspergillus flavus*)；

灰霉菌屬 (*Botrytis species*)，例如，灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*)；

20 青霉菌屬 (*Penicillium species*)，例如，擴展青霉菌 (*Penicillium expansum*) 及紫青霉 (*Penicillium purpurogenum*)；

菌核菌屬 (*Sclerotinia species*)，例如，油菜菌核病菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*)；

黃萎菌屬 (*Verticilium* species) , 例如 , 黃萎輪枝黴 (*Verticilium alboatrum*) ;

種子-與土壤-攜帶的腐爛與枯萎病之病原菌 , 例如 , 鏈格孢菌屬 (*Alternaria* species) , 例如 , 十字花科蔬菜黑斑病菌 (*Alternaria brassicicola*) ;

絲囊黴屬 (*Aphanomyces* species) , 例如 , 甜菜黑腐絲囊霉 (*Aphanomyces euteiches*) ;

殼二孢屬 (*Ascochyta* species) , 例如 , 兵豆殼二孢 (*Ascochyta lentis*) ;

麴黴屬 (*Aspergillus* species) , 例如 , 黃麴菌 (*Aspergillus flavus*) ;

星病菌屬 (*Cladosporium* species) , 例如 , 芽枝孢黴 (*Cladosporium herbarum*) ;

孢腔菌屬 (*Cochliobolus* species) , 例如 , 禾旋孢腔菌 (*Cochliobolus sativus*) (分生孢子型 : *Drechslera*, syn : 長蠕孢) ;

炭疽菌屬 (*Colletotrichum* species) , 例如 , 馬鈴薯炭疽病菌 (*Colletotrichum coccodes*) ;

镰孢菌屬 (*Fusarium* species) , 例如 , 大刀镰孢 (*Fusarium culmorum*) ;

赤黴菌屬 (*Gibberella* species) , 例如 , 玉蜀黍赤黴 (*Gibberella zeae*) ;

炭腐菌屬 (*Macrophomina* species) , 例如 , 炭腐病菌 (*Macrophomina phaseolina*) ;

雪黴菌屬 (*Monographella* species) , 例如 , 小麥雪腐病菌 (*Monographella nivalis*) ;

青黴菌屬 (*Penicillium* species) , 例如 , 擴展青黴菌 (*Penicillium expansum*) ;

5 莖點霉 (*Phoma* species) , 例如 , 黑腳病菌 (*Phoma lingam*) ;

黑漬瘍病菌屬 (*Phomopsis* species) , 例如 , 大豆莢腐病菌 (*Phomopsis sojae*) ;

疫病菌屬 (*Phytophthora* species) , 例如 , 疫黴菌 (*Phytophthora cactorum*) ;

10 核腔菌屬 (*Pyrenophora* species) , 例如 , 條斑病菌 (*Pyrenophora graminea*) ;

稻熱病菌屬 (*Pyricularia* species) , 例如 , 稻熱病菌 (*Pyricularia oryzae*) ;

15 腐霉菌屬 (*Pythium* species) , 例如 , 終極腐霉菌 (*Pythium ultimum*) ;

根腐病菌屬 (*Rhizoctonia* species) , 例如 , 立枯絲核菌 (*Rhizoctonia solani*) ;

根霉 (*Rhizopus* species) , 例如 , 米根霉 (*Rhizopus oryzae*) ;

20 白絹病菌屬 (*Sclerotium* species) , 例如 , 白絹病菌 (*Sclerotium rolfsii*) ;

殼針孢 (*Septoria* species) , 例如 , *Septoria nodonim* ;

淡紅核瑚菌屬 (*Typhula* species) , 例如 , 小麥雪腐菌 (*Typhula incarnata*) ;

黃萎病菌屬 (*Verticillium* species)，例如，棉花黃萎病菌 (*Verticillium dahliae*)；

潰瘍病 (cankers)、蟲癭 (galls) 及簇葉 (witches' broom) 疾病之病原菌，例如，

5 腐爛菌屬 (*Nectria* species)，例如，梨樹潰瘍菌 (*Nectria galligena*)；

枯萎病 (wilts) 之病原菌，例如，

褐腐菌屬 (*Monilinia* species)，例如，鏈核盤菌 (*Monilinia laxa*)；

10 葉、花與果實的變形之病原菌，例如，

外囊菌屬 (*Taphrina* species)，例如，畸形外囊菌 (*Taphrina deformans*)；

木質植物的退化性疾病之病原菌，例如，

15 *Esca* species，例如，*Phaemoniella clamydospora*、*Phaeoacremonium aleophilum* 及 *Fomitiporia mediterranea*；

花及種子疾病之病原菌，例如，

灰黴菌屬 (*Botrytis* species)，例如，灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*)；

植物球莖疾病之病原菌，例如，

20 根腐病菌屬 (*Rhizoctonia* species)，例如，立枯絲核菌 (*Rhizoctonia solani*)；

蠕形菌屬 (*Helminthosporium* species)，例如，馬鈴薯銀腐菌 (*Helminthosporium solani*)；

細菌性病原菌類，例如，

黃單胞桿菌屬(*Xanthomonas species*)，例如，野菜黃單胞桿菌(*Xanthomonas campestris pv. oryzae*)；

假單胞菌屬(*Pseudomonas species*)，例如，瓜類細菌性褐斑菌(*Pseudomonas syringae pv. Lachrymans*)；

5 軟腐病菌屬(*Erwinia species*)，例如，蘋果熱萎凋菌(*Erwinia amylovora*)；

較佳地，係用於對抗下述的大豆疾病類：

在葉子、莖、豆莢及種子上的真菌疾病，病原菌為，
例如，

10 葉斑點病(altemaria leaf spot) (*Altemaria spec. atrans tenuissima*)、炭疽病(anthraxnose) (*Colletotrichum gloeosporoides dematium var. truncatum*)、褐斑病(brown spot) (*Septoria glycines*)、葉斑與枯萎病(cercospora leaf spot and blight) (*Cercospora kikuchii*)、choanephora 葉枯萎病
15 (*Choanephora infundibulifera trispora* (syn.))、dactuliophora 葉斑病(*Dactuliophora glycines*)、霜黴病(downy mildew) (*Peronospora manshurica*)、drechslera 枯萎病(*Drechslera glycini*)、灰斑病(frogeye leaf spot) (*Cercospora sojina*)、leptosphaerulina 葉斑病(*Leptosphaerulina trifolii*)、
20 phyllosticta 葉斑病(*Phyllosticta sojaecola*)、豆莢與莖萎凋病(pod and stem blight) (*Phomopsis sojiae*)、白粉病(powdery mildew) (*Microsphaera diffusa*)、pyrenochaeta 葉斑病(*Pyrenochaeta glycines*)、絲核菌屬的空中結球，簇葉，與網狀枯萎(rhizoctonia aerial, foliage, and web blight) (立枯

絲核菌，*Rhizoctonia solani*)，銹病(*Phakopsora pachyrhizi*)，結痂病(scab)(*Sphaceloma glycines*)，黑腐病(stemphylium leaf blight) (*Stemphylium botryosum*)，高粱葉斑病(target spot) (*Corynespora cassiicola*)。

5 在根及莖基部的真菌病，病原菌為，例如，
黑根腐病(black root rot) (*Calonectria crotalariae*)、炭腐病(charcoal rot) (*Macrophomina phaseolina*)、fusarium枯萎或萎凋，根腐，及豆莢與根頸腐病(*Fusarium oxysporum*、*Fusarium orthoceras*、*Fusarium semitectum*、*Fusarium*
10 *equiseti*)、mycoleptodiscus 根腐病 (*Mycoleptodiscus terrestris*)、neocosmospora (*Neocosmospora vasinfecta*)、豆莢與莖萎凋(pod and stem blight) (*Diaporthe phaseolorum*)、莖腐(stem canker) (*Diaporthe phaseolorum* var. *caulivora*)、phytophthora 腐病 (*Phytophthora megasperma*)、褐莖腐病
15 (brown stem rot) (*Phialophora gregata*)、腐霉菌屬病 (*Pythium aphanidermatum*、*Pythium irregulare*、*Pythium debaryanum*、*Pythium myriotylum*、*Pythium ultimum*)、rhizoctonia根腐，莖腐朽，以及猝倒(立枯絲核菌，*Rhizoctonia solani*)、莖菌核病(sclerotinia stem decay) (油菜菌核病菌，*Sclerotinia sclerotiorum*)、白絹病(sclerotinia southern blight)
20 (白絹病菌，*Sclerotinia rolfsii*)、thielaviopsis根腐病 (根串珠黴，*Thielaviopsis basicola*)。

根據本發明的活性物質也呈現對植物之一種強烈的強化活性，它們因此適於供固定植物內在的防禦力以對抗不想要的微生物之攻擊。

5 本內文中所稱之植物-強化的(抗性-誘發的)物質，可理解的係指一種物質，當植物受到不想要的微生物接觸時，其具有能力激發植物的防禦系統，使經其處理過的植物顯現極大的抗性以對抗這些微生物。

10 在本情況下，可理解的，不想要的微生物係指植物病原性真菌、細菌及病毒，根據本發明的物質可因此被應用以保護植物，在經其處理後之一段時間，植物可受其保護免於有害病原菌之攻擊，此有效的保護期間通常為以活性化化合物處理植物後之1至10天，宜為自1至7天。

15 在用於控制植物疾病所需的濃度下，活性物可被植物耐受得很好的事實下，使其得以處理植物地表上面部分、植物之繁殖材料與種子、以及土壤。

20 就此方面，根據本發明的活性物質可相當成功地被應用於對抗致穀物生病之病菌，例如，銹菌屬(*puccinia species*)及在葡萄的栽培及在水果及蔬菜的栽培方面之病菌，例如，灰黴菌(*Botrytis*)、黑星菌(*Venturia*)或鏈格孢菌屬(*Alternaria species*)。

根據本發明的活性物質也適於供增加作物的產量，此外，它們對於植物具有較低的毒性且可被植物耐受得很好。

根據本發明的活性物質也可在特定的濃度及施用率下，選擇地被使用作為殺草劑、影響植物生長及對抗動物

有害生物之物質，它們也可選擇地被作為供合成另外的活性物質之中間物及前驅物。

根據本發明，有可能處理全株的植物及植物的各部位，就這方面，可理解的是，所稱之植物係指全部的植物與植物族群，例如，想要的與不想要的野生植物或被栽培的植物(包括天然出現的栽培的植物)；栽培的植物為可被種植、得自藉由傳統的育種及最適化方法或藉由生物科技的與基因工程法，或併用這些方法取得者，包括轉殖基因的植物與包括可受法牛對品種認證保護的與不被保護的植物品種；植物部分可理解的係指植物在地表上的與在地下部分的全部植物與器官，例如，幼芽、葉、花與根，可提及的實例為：葉子、針葉、莖桿、莖、花、果實體、水果以及種子，以及也包括根，塊莖與匍匐莖；植物部分也包括已收穫的材料及營養生長中部分及繁殖用材料，例如，種苗、球莖、匍匐莖、壓條(layers)及種子。

根據本發明以活性化合物處理植物與植物部分，係以傳統的方式直接地處理植物本身或作用其周圍、環境、生活空間或儲存處，例如藉由浸漬、噴灑、蒸散、霧化、撒佈、刷上、以及，對於繁殖材料，特別是種子，尚可藉由施用一或多層塗覆物之方式。

黴菌毒素(Mycotoxins)

此外，藉由根據本發明之處理，有可能用於減少已收穫的作物及由之製備之食品及飼料中之黴菌毒素含量，有

關此點，可特別予以提到，但非完全地代表者為下述之黴菌毒素：去氧雪腐鏟刀菌烯醇(deoxynivalenol, DON)、雪腐鏟刀菌烯醇(nivalenol)、15-Ac-DON、3-AC-DON、T2及HT2毒素、腐馬素毒素(fumonisin)、玉米烯酮毒素(zearalenone)、串珠鏟刀菌素(moniliformin)、鏟菌素(fusarin)、二乙醯蔗草鏟刀烯醇毒素(diacetoxyscirpenol, DAS)、白殭菌素(beauvericin)、恩鏟孢菌素(enniatin)、fusaroproliferin、fusarenol、赭麴毒素(ochratoxins)、棒曲霉素(patulin)、麥角生物鹼類(ergot alkaloids)及黃麴毒素(aflatoxins)，造成彼等之病原菌為，例如，下述之真菌：鏟孢菌(*Fusarium spec.*)，例如，銳頂鏟孢菌(*Fusarium acuminatum*)、*F. avenaceum*、*F. crookwellense*、黃色鏟孢菌(*F. culmorum*)、禾穀鏟孢菌(*F. graminearum*, *Gibberella zeae*)、木賊鏟孢菌(*F. equiseti*)、*F. fujikoroii*、*F. musarum*、尖孢鏟刀菌(*F. oxysporum*)、蕙蘭細斑病菌(*F. proliferatum*)、*F. poae*、*F. pseudograminearum*、接骨木鏟孢菌(*F. sambucinum*)、藤草鏟孢菌(*F. scirpi*)、半裸鏟孢菌(*F. semitectum*)、茄病鏟孢菌(*F. solani*)、擬枝孢鏟孢菌(*F. sporotrichoides*)、*F. langsethiae*、膠孢鏟孢菌(*F. subglutinans*)、三線鏟孢菌(*F. tricinctum*)、輪狀鏟孢菌(*F. verticillioides*)、等等，以及麴屬(*Aspergillus spec.*)、青黴屬(*Penicillium spec.*)、麥角菌(*Claviceps purpurea*)、穗黴菌屬(*Stachybotrys spec.*)，等等。

材料保護(Material protection)

在保護材料方面，根據本發明的物質可被應用供工業材料之保護，免於被不想要的微生物攻擊及毀損。

5 本發明內文中所稱之工業的材料，可理解的是指被製備供工業使用之無生命的材料，例如，想利用根據本發明的活性物質保護使免於受微生物改變或毀損之工業材料可以是粘著劑類、漿料、紙及卡紙、織品類、皮革、木料、塗料及塑膠製品、冷卻用潤滑劑類以及其他會受微生物攻擊或摧毀的材料；生產工廠的零件，例如，冷卻-水循環系統，其可能受微生物之增生而受損者，也為受保護的材料之範圍；
10 本發明就此目的可被提及之工業材料，較佳者為粘著劑類、漿料、紙及卡紙、皮革、木料、塗料、冷卻用潤滑劑類以及熱-轉移流體類，特別適宜的是用於保護木料。

可被提及的能造成工業材料的分解或改變之微生物實例為：細菌、真菌、酵母菌、藻類及粘液菌(slime)，根據本發明的活性物質較佳地為具有活性用於對抗真菌，特別是黴菌、使木頭褪色的及催毀木頭之真菌[擔子菌類(Basidiomycetes)]，及用於對抗粘液微生物及藻類。
15

可順便被舉之為例者為下述屬的微生物：

20 鏈格孢類(*Alternaria*)，例如，九層塔輪斑病菌(*Alternaria tenuis*)；

麴菌(*Aspergillus*)，例如，黑麴菌(*Aspergillus niger*)；

毛殼菌(*Chaetomium*)，例如，球毛殼菌(*Chaetomium globosum*)；

不完全菌(Coniophora)，例如，(*Coniophora puetana*)；

菌蕈類(Lentinus)，例如，香菇(*Lentinus tigrinus*)；

青黴菌(Penicillium)，例如，藍青黴(*Penicillium glaucum*)；

多孔菌(Polyporus)，例如，(*Polyporus versicolor*)；

5 黑管狀黃柄黴菌(Aureobasidium)，例如，出芽短梗黴菌(*Aureobasidium pullulans*)；

Sclerophoma，例如，(*Sclerophoma pityophila*)；

木黴菌(Trichoderma)，例如，綠色木黴菌(*Trichoderma viride*)；

10 埃希氏菌(Escherichia)，例如，埃希氏大腸桿菌(*Escherichia coli*)；

假單胞菌屬(Pseudomonas)，例如，綠膿桿菌(*Pseudomonas aeruginosa*)；

15 葡萄球菌(Staphylococcus)，例如，金黃色葡萄球菌(*Staphylococcus aureus*)。

配製物(Formulations)

20 本發明關於用於對抗不想要的微生物之一種組成物，係包含至少一種根據本發明之噻二唑基氧苯基脒類(噻二唑基oxyphenylamidines)。

此根據本發明之噻二唑基氧苯基脒類，視其個別的物理及/或化學性質，可被配製於標準的配製物內，例如，溶液、乳液、懸浮液、粉劑、泡沫、糊劑、粒劑、氣溶液、

被包球於聚合性物質內之極細微膠囊及供種子使用之塗覆材料，以及ULV冷-及熱-霧化的配製物。

這些配製物可藉由已知的方式配製，例如，藉由混合活性物質與展延劑，即，液體溶劑、加壓下之液化的氣體及/或固體載劑，選擇地使用界面活性劑，即，乳化劑及/或分散劑及/或泡沫劑；在使用水作為展延劑下，也有可能使用，例如，有機溶劑，作為輔助的溶劑，可溶的液體溶劑主要為：芳族烴類，例如，二甲苯、甲苯或烷基苯類；氯化的芳族烴類或氯化的脂肪族烴類，例如，氯苯類、氯乙烯類或二氯甲烷；脂肪族烴類，例如，環己烷或烯烴類，例如，石油分劃物；醇類，例如，丁醇或甘醇，以及彼等之醚類及酯類；酮類，例如，丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮或環己酮；強極性溶劑類，例如，二甲基甲醯胺及二甲亞砷；以及水；至於液化的氣體展延劑或載劑，係指在常溫常壓下為氣體之液體，例如，氣溶液噴射劑，例如，鹵化的烴類及丁烷、丙烷、氮氣及二氧化碳；可能的固體載劑為：例如，天然的經研磨過的礦物類，例如，高嶺土、粘土(argillaceous earths)、滑石、白堊、石英、凹凸棒石(attapulgite)、蒙脫土(montmorillonite)或矽藻土以及研磨過的合成的礦物，例如，高度分散的二氧化矽、氧化鋁及矽酸鹽類，供製作粒劑之適當的固體載劑類為：例如，碾碎及經分劃過的岩石，例如，方解石、輕石、大理石、海泡石、白雲石及無機及有機碎料之合成的粒劑，例如，鋸屑、椰子殼、玉米穗軸及煙草莖，可能的乳化劑及/或泡沫劑為，

例如，非-離子及陰離子性乳化劑類，例如，聚氧乙烯脂肪
酸酯類、聚氧乙烯脂肪醇醚類，例如，烷基芳基聚甘醇醚
類、烷基磺酸酯類、烷基硫酸酯類、芳基磺酸酯類及蛋白
質水解液類；可能的分散劑為：例如，木質素-亞硫酸廢液
及甲基纖維素。

有可能在配製物中使用粘著劑類，例如，羧甲基纖維
素、天然及合成的，呈粉狀、粒狀或乳膠態之聚合物類，
例如，阿拉伯膠、聚乙烯醇、聚乙烯醋酸酯，以及天然的
磷脂類，例如，腦磷脂與卵磷脂，以及合成的磷脂質類；
其他可能的添加物為礦物油類及植物油類。

也有可能用及著色劑，例如，無機色素類，例如，氧
化鐵、二氧化鈦、普魯士藍，以及有機著色劑類，例如，
茜素染料、偶氮染料類與金屬酞花青染料，以及微量營養
成分，例如，鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬與鋅之鹽類。

調配物中通常包含介於0.1與95%重量計的活性化合
物，較佳地為介於0.5與90%間者。

上述的配製物可被使用在根據本發明的方法中，用於
克制不想要的微生物，其中係將根據本發明之噻二唑基氧
苯基脒類施加至微生物及/或它們的居住環境。

種子處理(Seed treatment)

長久以來，已知可藉由處理植物的種子以克制植物致
病性真菌，且為被持續改良的目標，然而，在處理種子時，
常浮現一連串可能無法被滿意地解決的問題，於是，有必

要發展供保護種子及萌發中的植物之方法，使得不需在播種後或植物萌發後立即再施用作物保護劑或至少明顯地減少額外施用植物保護組成物；也有必要最適化所使用的活性化合物之量，使得對種子及萌芽中的植物給予最適當的保護，免於受到植物病原性真菌之攻擊，且所用的活性物質也不會傷害到植物本身；特別的，供處理種子的方法也應將轉殖基因植物內室的殺真菌性質列入考慮，使種子與萌芽中植物可以使用最低量的作物保護組成物達到最適當的保護作用。

本發明因此也關於，特別是一種用於保護種子與萌芽中的植物，使其免於受到病原性真菌攻擊的方法，係藉由以根據本發明的組成物處理種子。

本發明同樣也關於使用根據本發明的組成物用於處理種子以保護種子及萌芽中的植物，使其免於受到病原真菌侵害的用途。

此外，本發明也關於已經過根據本發明的組成物處理，受到保護可提供保護免於病原性真菌傷害之種子。

本發明的優點之一為，根據本發明的組成物之特別的全身性性質，以這些組成物處理種子，不僅能保護種子本身，也使得萌芽後的植物得到保護，免於病原性真菌之攻擊，以此種方式，可免除在作物播種時以及之後短時間內需立即進行的處理。

同樣的要被視為優點者係根據本發明的混合物也可被應用於，特別是轉殖基因植物的種子。

根據本發明的組成物適於供保護被應用在農業、溫室、林業或園藝中之任何植物品種的種子，有關的種子，特別是穀物的種子(例如，小麥、大麥、黑麥、小米及燕麥)、玉米、棉花、大豆、稻米、馬鈴薯、向日葵、豆子、咖啡、甜菜(例如，糖甜菜及飼料甜菜)、花生、蔬菜(例如，蕃茄、黃瓜、洋蔥及萵苣)、草坪及觀賞植物，特別重要的係用於處理穀類的種子(例如，小麥、大麥、黑麥及燕麥)、玉米及稻米。

本發明的內容中，根據本發明的組成物係單獨的或在適當的配製物內被施加至種子上，較佳地，種子應在相當穩定的狀態下被處理以避免在處理期間受到傷害；通常，種子可在介於收穫與播種間的任一時間點下被處理，所使用的種子通常為已分離自植物並已除去果莢、殼、莖桿、外皮、鬚毛或果肉者，於是，例如，有可能處理已被收穫、清理過及水分已被乾燥至15%重量以下者，或者，有可能處理乾燥後，經水處理並再乾燥之種子。

通常，在處理種子時，需非常地小心選用施加至種子的根據本發明之組成物的量及/或添加至種子上的其他添加物的量，以避免種子的萌發受到傷害或由之萌發的植物受到傷害，特別要牢記在心的是，在某種施用率下可能造成植物毒害效果之活性化合物。

根據本發明的組成物可直接地被施用，即是說，不需要包含另外的組分及被稀釋下使用；習慣上，宜以適當的配製物型式施用此組成物至種子；用於處理種子之適當的

配製物及方法，為本技藝中的行家所知，且被披露於，例如，下述文件中： US 4,272,417 A、US 4,245,432 A、US 4,808,430 A、US 5,876,739 A、US 2003/0176428 A1、WO 2002/080675 A1、WO 2002/028186 A2。

5 根據本發明可被使用之活性物質之組合物可被轉變成常用之種子敷料配製物內，例如，溶液、乳液、懸浮液、粉劑、泡沫、漿液或其他供塗覆種子的材料，以及ULV配製物。

10 這些配製物係以已知的方法製備，係藉由混合活性物質或活性物質組合物與傳統的添加物，例如，傳統的展延劑及溶劑或稀釋劑、著色物、潤濕劑、分散劑、乳化劑、抑泡劑、防腐劑、二級的增稠劑、糖著劑、赤黴素類(gibberellins)以及水。

15 存在於根據本發明可被使用之種子敷料配製物中之適當的著色劑包含供此目的使用之所有的著色劑類，在此，可使用難溶於水之色素類，及可溶於水之染料類兩者，可被提及的實例者為，被說明於Rhodamine B之C.I. Pigment Red 112及C.I. Solvent Red 1。

20 存在於根據本發明可被使用之種子敷料配製物中之適當的潤濕劑類包括傳統上被使用於農化活性物質的配製物中之可提升潤濕性之所有物質，較佳者可使用烷基萘磺酸酯類，例如，二異丙基-或二異丁基-萘磺酸酯類。

存在於根據本發明可被使用之種子敷料配製物中之適當的分散劑及/或乳化劑，包括傳統上被使用於農化活性物

質的配製物中之所有的非離子、陰離子及陽離子分散劑類，較佳地係使用非離子或陰離子分散劑或非離子與陰離子分散劑之混合物，特別可提及者，在適當的非離子分散劑中為，氧化乙烯/氧化丙烯成塊共聚物、烷基苯酚聚甘醇醚類以及三苯乙基苯酚聚甘醇醚類、及其磷酸化的或硫酸化的衍生物類，適當的陰離子分散劑類為，特別是，木質素磺酸鹽類、聚丙烯酸鹽類及芳基磺酸鹽/甲醛縮合物。

存在於根據本發明可被使用之種子敷料配製物中之抑泡劑類包括傳統上被使用於農化活性物質的配製物中之所有的泡沫-抑制的物質，較佳者係使用矽酮去泡劑及硬脂酸鎂。

可能存在於根據本發明可被使用之種子敷料配製物中之防腐劑類包括可在農化的組成物內供此目的使用之所有物質，順便可舉之為例者為二氯芬(dichlorophen)及苯甲醇半縮醛(benzyl alcohol hemiformal)。

可能存在於根據本發明可被使用之種子敷料配製物中之可能的二級增稠劑類包括可供此目的被使用在農化的組成物內之所有的物質，較適宜者為纖維素衍生物類、丙烯酸衍生物類、黃原膠(xanthan)、修飾過的粘土類及高度地分散的二氧化矽。

存在於根據本發明可被使用之種子敷料配製物中之可能的粘結劑類，包括可被使用在種子敷料中之所有傳統的粘結劑類，可提及的較佳的實例為，聚乙烯吡咯酮、聚乙烯乙酸酯、聚乙烯醇及羥乙基纖維素醚(tylose)。

存在於根據本發明可被使用之種子敷料配製物中之可能的赤黴素類(gibberellins)較佳地包含赤黴素類A1、A3(=赤黴素酸)、A4及A7；用途上特別佳地係利用赤黴素酸；赤黴素類(gibberellins)係已知的化合物(參考： R. Wegler, "Chemie der Pflanzenschutz- und Schadlingsbekämpfungsmittel" [Chemistry of 植物保護及有害生物防制劑之化學], Vol. 2, Springer Verlag, 1970, pp. 401-412)。

根據本發明可被使用之種子敷料配製物，可直接地或經水稀釋後，用於處理大部分不同品種之種子，於是，可藉由以水稀釋取得之濃縮物或組成物，可被用於供塗敷穀類之種子，例如，小麥、大麥、黑麥、燕麥及黑小麥，以及玉米、水稻、蕁薹、豌豆、豆子、棉花、向日葵及甜菜的種子，或是大部分不同本質之蔬菜的種子；根據本發明可被使用之種子敷料配製物或其稀釋的組成物也可被使用作為轉殖基因作物的種子之敷料，就此方面，可能因與表現而得之物質的交互作用，而出現額外的協乘效果(synergistic effects)。

可被方便的地使用供塗敷之所有的混合的設置，為適於以根據本發明可被使用之種子敷料配製物或藉由加水由其製備得的組成物處理種子者，明確地說，塗敷的過程係將種子導引入一種混合機內，可於加水稀釋之前或之後，每次加入所需之適量的種子敷料配製物，再進行混合，直到配製物被均勻地分佈在種子上，適當地，接著可進行乾燥操作。

根據本發明可被使用之種子敷料配製物的施用率可在很大的範圍內變化，視在配製物內之活性物質的個別的含量以及種子而定，活性物質組合物之施用率通常為介於0.001與50克/公斤種子，較佳地為介於0.01與15克/公斤種子間。

與已知的殺真菌劑、殺菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑或殺昆蟲劑的混合物

根據本發明之脘類，可以原狀或呈其配製物，或與已知的殺真菌劑、殺菌劑、殺蟎劑、殺線蟲劑或殺昆蟲劑配成混合物型式被使用，係為了，例如，增廣活性譜或預防抗性之發展。

也可能與其他已知活性物質，例如，殺草劑類，或與肥料及生長調節劑類、安全劑類或化學信息物質(semiochemicals)，作成混合物使用。

此外，根據本發明之式(I)之化合物也呈現極佳的抗黴菌活性，它們具有極廣的抗黴菌活性譜，特別對抗皮癬菌及出芽真菌、黴菌及二相的真菌(例如，對抗念珠菌屬菌，例如，白色念珠菌、Candida glabrata)、及絮狀表皮癬菌(Epidermophyton floccosum)、麴菌屬菌[例如，黑色麴菌(Aspergillus niger)及煙色麴菌(Aspergillus fumigatus)]、髮癬菌屬(Trichophyton species)菌[例如髮癬菌(Trichophyton mentagrophytes)]、小芽孢菌屬(Microsporon)菌[例如，犬小芽孢菌(Microsporon canis)及Microsporon audouinii]，所列

的這些真菌僅是為了說明起見，不以任何方式限制僅有這類黴菌譜。

根據本發明之噻二唑基氧苯基脒類因此可被使用於醫學的及非醫學的應用兩方面。

5 活性物質之施用可為，在其配製物中之型式或為由配製物調配的使用型式，像是，即用的溶液、懸浮劑、可濕性粉末、糊劑、可溶解的粉劑、塵劑及粒劑，可藉由標準的方式進行施用，例如，藉由傾倒、噴灑、霧化、撒佈、塵染、泡沫、散佈，等等，也可藉由超低容量法施用活性
10 化合物，或藉由注射活性物質組成物或活性物質本身至土壤內。

也可供處理植物的種子。

當根據本發明之噻二唑基氧苯基脒類被作為殺真菌劑時，視施用的類型，施用率可在相對廣之範圍間變化，以
15 處理植物部分時，活性物質之施用率通常為介於0.1與10 000克/公頃間，宜為介於10與1000克/公頃間；當用於處理種子時，活性物質之施用率通常為介於0.001與50克/公斤種子間，宜為介於0.01與10克/公斤種子間；當用於處理土壤時，活性化合物之施用率通常為介於0.1與10 000克/公頃
20 間，宜為介於1與5000克/公頃間。

如前面已提過的，根據本發明可處理全部植物及其各部位，於一較佳的具體實施例中，用於處理野生植物品種及植物栽培品種，或那些藉由傳統生物育種方法，例如那些經雜交或原生質融合而取得的植物，以及其各部位；在

另一較佳的具體實施例中，用於處理藉由基因工程法，選擇地併用傳統方法取得之轉殖基因植物與植物栽培品種(基因改造的有機體)，以及其各部位；所謂的「部位」、「植物的部位」或「植物部分」，其含義如前面的解釋。

5

GMOs

根據本發明之處理方法可被使用於處理基因改造的有機體(GMOs)，例如，植物或種子；基因改造的植物(或轉殖基因植物)係一種已將異源的基因穩定地整合入其基因體的植物，所謂的「異源的基因」，基本上係指一種基因，其係由外面的植物提供或組裝且當被引入至核、細胞質或粒線體的基因組(genome)時，藉由表現有利的蛋白質或多肽，或藉由往下游調整(downregulating)或靜默(silencing)其他已存在於植物內之基因[例如，使用反義(antisense)技術、共壓制技術(cosuppression technology)或RNA干擾-RNAi技術]，給予經轉移的植物一種新的或改進的農藝上或其他的性質，位於基因組內之異源的基因也被稱之為一種轉殖基因，以其在植物基因組內之特別的位置被定義之一種轉殖基因被稱之為一種轉化(transformation)或轉殖基因項(transgenic event)。

10

15

20

視植物的品種或植物栽培品種，其分佈與生長條件(土壤、氣候、營養生長期間、營養狀態)，根據本發明的處理也可導致超加成的(「協乘的」)效果，於是，例如，減少的施用率及/或增廣的活性譜及/或增加可根據本發明被使用

的活性物質及組成物的活性、較佳的植物生長、增加耐性於高溫或低溫、更耐乾旱或耐水或耐土壤鹽分含量、增加的開花期、更容易的收割、加速的成熟、更高的收穫量、較大的果實、較高的植物、更綠的葉子、更易開花、更佳

5 的品質及/或收穫物具較高的營養價值、更甜的果實、收穫品的更佳儲存安定性及/或加工性，均可能超出實際被預期的效果。

在某種施用率下，根據本發明之活性物質組成物也在植物內具有一種強化的效果，因此，它們適於供固定化植物的防禦系統以對抗不想要的植物病原性真菌及/或微生物及/或病毒之攻擊，如果適當，這可能是使根據本發明的組合物增強活性(例如，對抗真菌)的原因之一，植物-強化的(抗性誘發的)物質在本文中的含義，可被理解的是指那些物質或物質的組合物，其能刺激起植物的防禦系統，使得當

10 植物接著被接種上不想要的植物病原性真菌及/或微生物及/或病毒時，經處理過的植物可顯現對於不想要的植物病原性真菌及/或微生物及/或病毒具有實質程度的抗性；在本案例下，不想要的植物病原性真菌及/或微生物及/或病毒，可理解的係指植物病原性真菌、細菌及病毒，於是，根據本

15 發明之物質可被應用於供保護植物方面，經本發明之物質處理後，可以對抗上述病原菌之攻擊達一段期間，保護的有效期間通常可達1至10天，較佳的為經活性物質處理植物後之1至7天。

20

根據本發明適宜被處理的植物及植物栽培品種，包括具有參與了特別有利的、有用的特色至植物的基因材料之所有植物(不管是藉由育種及/或生物技術方式取得者)。

根據本發明也適宜被處理的植物及植物栽培品種為，具抗性對抗一或多種生物逆境(biotic stresses)者，即，所述之植物顯現一種較佳的防禦性以對抗動物及微生物有害生物，例如，線蟲、昆蟲、蟎、植物病原性真菌、細菌、病毒及/或類病毒。

根據本發明也可被處理的植物及植物栽培品種為那些具有抗性對抗一或多種非生物逆境的植物，非生物逆境條件可能包括，例如，乾旱、曝露於低溫、熱曝露(heat exposure)、滲透的壓力(osmotic stress)、溢流(flooding)、增加的鹽度(increased soil salinity)、增加的礦物質曝露(increased mineral exposure)、臭氧曝露(ozone exposure)、高光照(high light exposure)、氮營養素不足(limited availability of nitrogen nutrients)、磷營養素不足、樹蔭遮蔽(shade avoidance)。

根據本發明也可被處理的植物及植物栽培品種，為那些具下述特徵之植物：提升的收量特性、可導致所述植物之增加產量，例如，改善的植物生理、生長及發育，像是，水利用效率、水滯留效率、增加的氮使用、增加的碳吸收、增進的光合作用、增加的發芽效率及加速的成熟；收量可藉由改善的植物屬性(在壓力及非-理力條件下)被影響，包括，提早開花、開花的控制供雜交種子生產、幼苗茁壯、

植物體型、節間數目及距離、根生長、種子大小、果實大小、豆莢大小、豆莢或穗的數目、每個豆莢或穗內種子的數目、種子之質量、增加種子飽滿度、減少種子消散、減少豆莢裂開及抗倒伏性(lodging resistance)；另外的收量特色包括種子組成，例如，碳水化合物含量、蛋白質含量、油含量及組成、營養價、減少抗營養的化合物、改善的加工性狀及較佳的儲存安定性。

可根據本發明被處理之植物為已表現雜種優勢(heterosis或hybrid vigour)特性之雜交的植物，其通常表現較高的收量、較有活力、較健康及對生物及非生物的逆境因子具有抗性，這樣的植物典型地係由一種先天雄性-不育的親系(母系)與另種先天雄性-可育的親系(父系)經由雜交所得，雜交的種子典型地收穫自雄性-不育的植物並被賣給栽種者，雄性不育的植物有時候(例如，在玉米之情況)可由除去穗狀雄花(即，機械移除雄性繁殖器官或雄花)達成，但更典型地，雄性不育係由植物基因組內之遺傳決定因素所導致，在這樣的情況，且尤其是當種子為得自雜交的植物之所要收穫的產物時，為典型的有用於確保持造成雄性不育的含遺傳決定因素之雜交植物的雄性可育性得以完全恢復之方法，可藉由擔保父系中具有適當的繁殖性恢復基因(fertility restorer genes)，恢復含有關雄性不育之遺傳決定因素的雜交植物中之雄性可育性；相關雄性不育的遺傳決定因素可能位於細胞質中，細胞質的雄性不育性(CMS)之實例，被描述於，例如，蕓薹屬(*Brassica*

species)的植物中(WO 1992/005251、WO 1995/009910、WO 1998/27806、WO 2005/002324、WO 2006/021972及US 6229072)，然而，雄性不育的遺傳決定因素也可能位於核的基因組內；雄性不育植物也可藉由植物生物技術方法取得，例如，基因工程法；取得雄性-不育的植物之特別有用的方法被揭露於WO 89/10396，其中，例如，一種核糖核酸酶(例如，barnase)被選擇地表現於雄蕊(stamens)之絨毛細胞(tapetum cells)中，藉由表現在絨毛細胞內之核糖核酸酶抑制劑[例如，barstar(例如，WO 1991/002069)，可恢復其繁殖力。

可根據本發明被處理之植物或植物栽培品種(得自植物生物技術方法，例如，基因工程法)為一種耐殺草劑的植物，即，可耐一或多種殺草劑之植物，這樣的植物可藉由基因轉移，或藉由挑選含有耐這類除草劑的變異因子者取得。

耐殺草劑的植物為，例如，耐-嘉磷塞(glyphosate)植物，即，對除草劑嘉磷塞(glyphosate)或其鹽類具耐受性者，例如，耐嘉磷塞(glyphosate)的植物可得自，藉由基因編碼5-烯醇丙酮醯基莽草酸-3-磷酸酯合成酶(EPSPS)之酵素將植物轉化，這類EPSPS基因之實例為沙門氏菌(*Salmonella typhimurium*)之AroA基因(突變種CT7)(Comai et al., Science (1983), 221, 370-371)、Agrobacterium sp.細菌之CP4基因(Barry et al., Curr. Topics Plant Physiol. (1992), 7, 139-145)、編碼一種矮牽牛(petunia)EPSPS之基因(Shah et al.,

Science (1986), 233, 478-481)、一種蕃茄的EPSPS (Gasser et al., J. Biol. Chem. (1988), 263, 4280-4289)或一種牛筋草 (eleusine)之EPSPS (WO 2001/66704), 也可以是一種變異的EPSPS, 如被描述於, 例如, 下面之文件者: EP-A 0837944、
5 WO 2000/066746、WO 2000/066747或WO 2002/026995, 耐
嘉磷塞的植物也可藉由一種編碼一種嘉磷塞氧化還原酶之
酵素取得, 例如被描述於US 5 776 760及US 5 463 175中
者, 耐嘉磷塞的植物也可得自表現編譯一種嘉磷塞乙醯基
轉移酶之一種基因, 例如, 被描述於WO 2002/036782、WO
10 2003/092360、WO 2005/012515及WO 2007/024782中者, 耐
嘉磷塞的植物也可得自: 挑選含上述基因之天然出現的突
變之植物, 例如, 被描述於WO 2001/024615或WO
2003/013226中者。

其他的耐殺草劑之植物為, 例如, 被做成耐受用於抑
15 制麩胺醯胺合成酶的殺草劑者, 例如, 畢拉草(bialaphos)、
磷三辛(phosphinotricin)或固殺草(glufosinate), 這類植物可
得自: 藉由表現一種去殺草劑毒性的一種酵素或可耐受抑
制作用之穀胺醯胺合成酶之變異株, 這種有效的去毒性之
酵素之一種為, 編碼一種磷三辛乙醯基轉移酶
20 (phosphinotricin acetyltransferase)的一種酵素(例如, 得自鏈
黴菌屬(*Streptomyces species*)之bar或pat蛋白質), 例如, 表
現一種外源的(exogenous)磷三辛乙醯基轉移酶的植物被揭
露於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。

其他的耐殺草劑的植物也為可耐受用於抑制羥苯基丙酮酸鹽二氧化酶(HPPD)的殺草劑者，羥苯基丙酮酸鹽二氧化酶係一種用於催化對-羥基苯基丙酮酸(HPP)轉形成黑尿酸(homogentisate)的反應之酵素，耐HPPD抑制劑類之植物可以編碼一種天然地出現的抗性HPPD酵素被轉化，或以一種編碼一種突變的HPPD酵素者被轉化，如被揭露於WO 1996/038567、WO 1999/024585及WO 1999/024586中者；對HPPD抑制劑類之耐受性也可得自，藉由以基因編碼某種酵素使能形成黑尿酸(homogentisate)之轉化的植物而不管藉由HPPD抑制劑之天然的HPPD酵素的抑制作用，這樣的植物及基因被揭露於WO 1999/034008及WO 2002/36787；植物對HPPD抑制劑類之耐受性也可藉由除了一種基因編碼一種耐HPPD的酵素，也包含一種基因編碼預苯酸脫氫酶(prephenate dehydrogenase)的一種酵素轉化的植物增強，例如被揭露於WO 2004/024928中者。

另類耐殺草劑之植物係可耐受乙醯基乳酸合成酶(acetolactate synthase, ALS)抑制劑類之植物，已知的ALS抑制劑類包括，例如，磺醯基脲(sulphonylurea)、咪唑啉酮(imidazolinone)、三唑并嘧啶類、嘧啶基氧(硫)苯甲酸酯類及/或磺醯基胺基羧基三唑啉酮殺草劑類，在ALS酵素內之不同的突變(也稱之為乙醯羥基酸合成酶, AHAS)也為已知的耐不同類殺草劑之者，被揭露於，例如，Tranel and Wright,

Weed Science (2002), 50, 700-712, 也被披露於US 5 605 011、US 5 378 824、US 5 141 870及US 5 013 659中；耐磺
醯基脲的植物及耐咪唑啉酮(imidazolinone)的植物被披露
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、以及國際公開刊物WO
1996/033270中，其他耐咪唑啉酮的植物也被揭露於，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內；另外的耐磺醯基脲
及耐咪唑啉酮植物也被揭露於，例如，WO 2007/024782。

其他耐咪唑啉酮及/或耐磺醯基脲的植物可得自誘發
的突變形成、在殺草劑存在下挑選自細胞培養基或突變育
種，如被描述於，例如，US 5 084 082中之大豆、WO
1997/41218中之稻米、US 5 773 702及WO 1999/057965中之
製糖用甜菜、US 5 198 599中之萵苣、或WO 2001/065922
中之向日葵。

也可根據本發明被處理之植物或植物栽培品種(得自
植物生物技術方法，例如，基因工程法)為，耐受-昆蟲的轉
殖基因植物，即，可耐受某種被設想的昆蟲攻擊之植物，
這樣的植物可得自基因轉化、或藉由選擇含有摻入這類昆
蟲耐受性的植物。

「耐受昆蟲的轉殖基因的植物」，在此係指任一種植物，其係包括含有至少一個包含編譯下述物質之一種編碼序列的轉殖基因：

- 1) 得自蘇力桿菌之一種殺昆蟲的晶體蛋白質或一種殺昆蟲的部分，例如，被 Crickmore et al., 列示於 Microbiology and Molecular Biology Reviews (1998), 62, 807-813 中之殺昆蟲的晶體蛋白質，被 Crickmore et al. (2005)更新於 *Bacillus thuringiensis* toxin nomenclature，位於：http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/），或是其殺昆蟲的部位，例如，Cry 蛋白質類之蛋白質：Cry1Ab、Cry1Ac、Cry1F、Cry2Ab、Cry3Ae 或 Cry3Bb 或其殺昆蟲的部位；或
- 2) 得自蘇力桿菌的一種晶體蛋白質或其一部分，在來自蘇力桿菌(*Bacillus thuringiensis*)或其一部分的第二種其他的晶體蛋白質存在下，例如，由 Cy34 與 Cy35 晶體蛋白質組成之二元的毒素，具有殺昆蟲的性質 (Moellenbeck et al., Nat. Biotechnol. (2001), 19, 668-72; Schnepfet al., Applied Environm. Microb. (2006), 71, 1765-1774)；或
- 3) 一種雜種的殺昆蟲之蛋白質，包含來自蘇力桿菌之兩不同的殺昆蟲的晶體蛋白質之部分，例如，上述 1)之蛋白質之一種混合物或上述 2)之蛋白質之一種混合物，例如，由玉米事件 MON98034 產生之 Cry1A. 105

蛋白質(WO 2007/ 027777)；或

- 4) 上述 1)至 3)中任一項的蛋白質，其中一些，特別是 1 至 10 個胺基酸已被替代成其他的胺基酸，以取得較高的殺昆蟲活性對抗標靶昆蟲種類、及/或擴展可影響的目標昆蟲種類之範圍、及/或由於在選殖或轉殖(transformation)期間被導入至編碼的 DNA 之改變，例如，在玉米轉殖項 MON863 或 MON88017 中之 Cry3Bb1 蛋白質，或在玉米轉殖項 MIR 604 中之 Cry3A 蛋白質；
- 5) 來自蘇力桿菌或仙人掌桿菌(*Bacillus cereus*)之一種殺昆蟲的分泌的蛋白質，或其殺昆蟲的一部分，例如，營養期殺蟲蛋白(VIP)，被列於：[http : //www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html](http://www.lifesci.sussex.ac.uk/Home/Neil_Crickmore/Bt/vip.html)，例如，來自 VIP3Aa 蛋白質類之蛋白質；或
- 6) 來自蘇力桿菌或仙人掌桿菌之一種分泌的蛋白質，在來自蘇力桿菌或仙人掌桿菌之第二種分泌的蛋白質存在下具有殺昆蟲的作用，例如，由 VIP1A 及 VIP2A 蛋白質經合成之二元的毒素(WO 1994/21795)；
- 7) 一種雜種的殺昆蟲之蛋白質，包含來自蘇力桿菌或仙人掌桿菌之不同的分泌的蛋白質之部分，例如，上述 1)之蛋白質之一種混合物或上述 2)之蛋白質之一種混合物；或
- 8) 上述 1)至 3)中任一項的蛋白質，其中一些，特別是 1

至 10 個胺基酸已被替代成其他的胺基酸以取得較高的殺昆蟲活性對抗標靶昆蟲種類、及/或擴展可影響的目標昆蟲種類之範圍、及/或由於在選殖或轉殖期間(仍編碼一種殺昆蟲的蛋白質)，被導入至編碼的 DNA 之改變，例如，在棉花轉殖項 COT 102 中之 VIP3Aa 蛋白質。

當然，在此之一種耐受昆蟲之轉殖基因的植物，也包含任何植物，其係包含編碼上述 1 至 8 類中任一項的蛋白質之基因的組合物；一具體實施例中，一種耐受昆蟲之植物含有多於一個用於編碼上述 1 至 8 類的任一種蛋白質的轉殖基因，用於擴展受影響的標靶昆蟲種類的範圍或藉由使用不同的蛋白質殺蟲劑給相同的目標昆蟲種類，但其具有不同的作用模式，例如，結合至昆蟲內之不同的受體結合位置，用於延遲昆蟲對植物的抗性之發展。

也可根據本發明被處理之植物或植物栽培品種(得自植物生物技術方法，例如，基因工程法)為耐受非生物逆境之植物，這類植物可藉由基因轉殖、挑選含有突變因子於這類逆境抗性的植物，特別有用的耐逆境之植物包括：

- a. 含有在植物細胞或植物中能減少表現及/或聚(ADP-核糖)聚合酶(PARP)基因的活性之一種轉殖基因的植物，如揭露於 WO 2000/004173 或 EP 04077984.5 或 EP 06009836.5 中者；
- b. 含有能減少植物或植物細胞的表現及/或 PARG 編碼的

基因的活性之一種逆境(stress)耐受性提升的轉殖基因之植物，如被揭露於，例如，WO 2004/090140 中者；

- c. 含有一種逆境耐受性提升的轉殖基因供編寫菸鹼醯胺腺嘌呤二核苷酸補救生合成路徑(nicotinamide adenine dinucleotide salvage biosynthesis pathway)的一種植物-功能的酵素之植物，包括，菸鹼醯胺酶(nicotinamidase)、菸鹼酸磷酸核糖轉移酶(nicotinate phosphoribosyltransferase)、菸鹼酸單核苷酸酞腺嘌呤基轉移酶(nicotinic acid mononucleotide adenylyltransferase)、菸鹼醯胺腺嘌呤二核苷酸合成酶(nicotinamide adenine dinucleotide synthetase)或菸鹼醯胺磷酸核糖基轉移酶(nicotinamide phosphoribosyltransferase)，如被揭露於，例如，EP 04077624.7 或 WO 2006/133827 或 PCT/EP07/002433 中者。

也可根據本發明被處理之植物或植物栽培品種(得自植物生物技術方法，例如，基因工程法)顯現改變的量、品質及/或收穫的產品之儲存安定性及/或收穫的產品之特有的成分之改變的性質，例如：

- 1) 合成一種經修飾的澱粉之轉殖基因植物，其中澱粉之物理-化學特性，特別是直鏈澱粉的含量或直鏈澱粉/支鏈澱粉的比例、分枝的程度、平均鏈長、側鏈分佈、粘性行為、膠凝強度、澱粉顆粒大小及/或澱粉顆粒之形態，與野生類型植物細胞或植物中被合成的澱粉相比較，是被改變了，使得此修飾的澱粉更適於特殊的

應用；所述轉殖基因植物合成的一種修飾澱粉被揭露
於，例如，於 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、WO
99/58688、WO 1999/58690、WO 1999/58654、WO
2000/008184、WO 2000/008185、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 或 WO 1997/20936 中。

- 2) 合成非澱粉碳水聚合物或合成帶有具改變性狀的(與未經改造的野生型態的植物相比較而言)之非澱粉碳水聚合物之轉殖基因植物，實例為，產生聚果糖(polyfructose)之植物，尤其是菊糖(inulin)與果聚糖(levan)類型，如被揭露於 EP 0 663 956、WO 1996/001904、WO 1996/021023、WO 1998/039460 及 WO 1999/024593 中者，產生 α -1,4-葡聚糖(glucans)之植物，如被揭露於 WO 1995/031553、US 2002/031826、US 6 284 479、US 5 712107、WO 1997/047806、WO 1997/047807、WO 1997/047808 及 WO 2000/14249 中者，產生 α -1,6 分枝的 α -1,4-葡聚糖之植物，如被揭露於 WO 2000/73422 中者，以及產生 alternan(一種葡聚糖)之植物，如被揭露於 WO 2000/047727、EP 06077301.7、US 5 908 975 及 EP 0 728 213 中者。
- 3) 產生玻璃酸(hyaluronan)之轉殖基因植物，實例為，如被揭露於 WO 2006/032538、WO 2007/039314、WO 2007/039315、WO 2007/039316、JP 2006/304779 及 WO 2005/012529 中者。

也可根據本發明被處理之植物或植物栽培品種(得自植物生物技術方法，例如，基因工程法)為下述植物：例如，棉花植物，具改變的纖維性狀者；這類植物可得自基因轉化，或藉由挑選含有參與這類改變的纖維性狀之突變種且

包括：

- a) 植物，例如，棉花植物，含有改變的型式之纖維素合成酶基因，如 WO 1998/000549 中之描述；
- b) 植物，例如，棉花植物，含有 rsw2 或 rsw3 同源的核酸類之改變的型式，如被揭露於 WO 2004/053219 中者；
- c) 植物，例如，棉花植物，具增加的蔗糖磷酸合成酶表現者，如被揭露於 WO 2001/017333 中者；
- d) 植物，例如，棉花植物，具增加的蔗糖合成酶表現者，如被揭露於 WO 02/45485 中者；
- e) 植物，例如，棉花植物，其中在纖維細胞主要部分之胞質間連絲的門路(plasmodesmatal gating)的安排被改變了，例如，經由往下調節纖維選擇的 β -1,3-葡聚糖酶，如被揭露於 WO 2005/017157 中者；
- f) 植物，例如，棉花植物，具有改變的反應性之纖維，例如，經由 N-乙酰基葡萄糖胺轉移酶基因之表現，包括，nodC 及幾丁合成酶基因，如被揭露於 WO 2006/136351 中者。

也可根據本發明被處理之植物或植物栽培品種(得自植物生物技術方法，例如，基因工程法)為一種植物，例如，油菜或相關的芸薹屬植物，具改變的油分佈性狀，這類植物可得自基因轉化，或藉由挑選含有參與這類改變的油性狀之突變種且包括：

- a) 植物，例如，油菜植物(oilseed rape plants)，產生具高油酸含量者，例如，被揭露於 US 5 969 169、US 5 840

946、US 6 323 392 或 US 6 063 947 中者；

b) 植物，例如，油菜植物，產生具低亞麻酸(linolenic acid)含量者，如被揭露於 US 6 270 828、US 6 169 190 或 US 5 965 755 中者；

5 c) 植物，例如，油菜植物，產生具有低的飽和的脂肪酸的油質者，如被揭露於，例如，US 5 434 283 中者。

可根據本發明被處理之特別有用的轉殖基因的植物為，包含用於編碼一或多種毒素之一或多個基因之轉殖基因的植物，彼等以下述商標被股售：YIELD GARD® (例如，
10 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)、Nucota® (棉花)、Nucotn 33B® (棉花)、NatureGard® (例如，玉米)、Protecta®及 NewLeaf® (馬鈴薯)。

15 可被提及之耐受殺草劑之植物的實例為：以下述商標被販售之玉米品種、棉花品種、及大豆品種：Roundup Ready® [耐嘉磷塞(glyphosate)，例如，玉米、棉花、大豆]、Liberty Link® [耐磷三辛(phosphinotricin)，例如，油菜]、IMI® [耐咪唑啉酮(imidazolinone)]及 SCS® [耐磺醯基脲(sulphonylurea)，例如，玉米]；可被提及之耐受殺草劑的植物(以傳統方法育成之耐殺草劑植物)包括以 Clearfield®商
20 標被販售之品種(例如，玉米)。

可根據本發明被處理之特別有用的轉殖基因植物為，含有轉殖項目(transformation events)，或一種轉殖項目的組

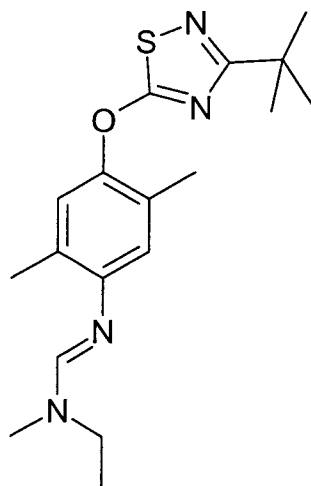
合，其被列於，例如，來自全國或地方管理機構之資料庫中者(見，例如，http://gmoinfo.jrc.it/gmp_browse.aspx 以及 <http://www.agbios.com/dbase.php>)。

根據本發明的活性物質之製備及用途被更詳細的說明於下述實例中，但不僅限於這一些實例。

【實施方式】

製備實例

製備實例 1：N'-{4-[3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-2,5-二甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亞胺基甲鹽胺(A-1)



(A-1)

將 17.46 克(63.00 毫莫耳)的 4-[3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-2,5-二甲基苯胺溶解於 500 毫升的三甲基正甲酸酯後，加熱迴流 2 小時，冷卻至常溫(AT)後，在真空下濃縮除去溶劑，殘留物被置入於 630 毫升的二氯甲烷內，加入 8.65 毫升(126.00 毫莫耳)的 N-乙基-N-甲基胺，在常溫下攪拌 18 小時，除去溶劑後，粗製品藉由管柱層析法純化(13.4 克, 59%收量, 95%純度, log P (pH 2.3)=2.02)。

$^1\text{H NMR}$ (DMSO): $\delta=7.64$ (1H, s), 7.09 (1H, s), 6.75 (1H, s), 3.38 (2H, q), 2.93 (3H, s), 2.15 (3H, s), 2.11 (3H, s), 1.31 (9H, s), 1.15-(3H, t)。

5 起始材料之合成(Synthesis of the starting materials):

4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噁二唑-5-基)氧]-2,5-二甲基苯胺

將 754 毫克(5.50 毫莫耳)的 2,5-二甲基-4-羥基苯胺溶解於 5 毫升的 N,N-二甲基甲醯胺後，慢慢地加入 242 毫克(6.05 毫莫耳)的氫化鈉，將反應混合物攪拌 15 分鐘，再加入 972 毫克(5.50 毫莫耳)的 3-(第三-丁基)-5-氯-1,2,4-噁二唑，接著，在 100°C 下將反應混合物加熱 1 小時後，冷卻至常溫，添加 20 毫升的乙酸乙酯，溶液經水萃取三遍，並經 MgSO_4 乾燥，在真空下除去溶劑(1.46 克, 94% 純度, 90% 收量, $\log P$ (pH 2.3)=3.29)。

15 3-(第三-丁基)-5-氯-1,2,4-噁二唑

將 6.83 克(50.00 毫莫耳)的第三-丁基甲脒鹽酸鹽溶解於 60 毫升的二氯甲烷後，加入 8.37 克(45.00 毫莫耳)的三氯甲碘醯基氯，將反應混合物冷卻至 -15°C，滴入溶解於 20 毫升的水中之 10.00 克(250 毫莫耳)之氫氧化鈉溶液，在常溫下將混合物攪拌 3 小時，添加 50 毫升的二氯甲烷，經水萃取三遍，合併有機層，經 MgSO_4 乾燥，真空下蒸發除去溶劑(5.81 克, 90% 純度, 60% 收量, $\log P$ (pH 2.3)=3.44)。

製備實例 2：(A-2) N'-{4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-2,5-二甲基-苯基}-N-異丙基-N-甲基亞胺基甲醯胺

¹H NMR (DMSO) : δ=7.69 (s, 1H), 7.08 (s, 1H), 6.75 (s, 1H), 2.86 (s, 3H), 2.15 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.31 (s, 9H), 1.20 (s, 3H), 1.19 (s, 3H)。

製備實例 3：(A-3) 4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-2,5-二甲基-N-[(1E)-六氫吡啶-1-基亞甲基]苯胺

¹H NMR (DMSO) : δ=7.61 (s, 1H), 7.09 (s, 1H), 6.76 (s, 1H), 3.45 (m, 4H), 2.14 (s, 3H), 2.11 (s, 3H), 1.63 (m, 2H), 1.53 (m, 4H), 1.31 (s, 9H)。

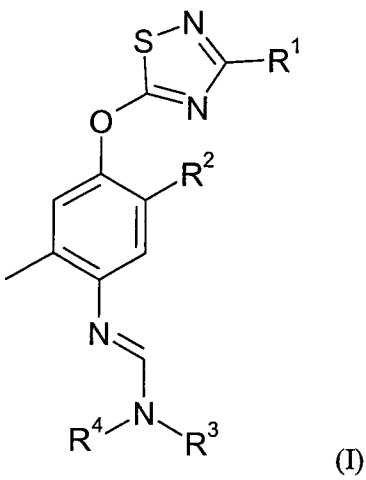
製備實例 8：(A-8) N'-{4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-5-氯-2-甲基苯基}-N-乙基-N-甲基亞醯胺基甲醯胺

¹H NMR (DMSO) : δ=7.77 (s, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.05 (s, 1H), 3.41 (m, 2H), 2.97 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.31 (s, 9H), 1.15 (t, 3H)。

製備實例 9：(A-9) 4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-5-氯-2-甲基-N-[(1E)-六氫吡啶-1-基亞甲基]苯胺

¹H NMR (DMSO) : δ=7.73 (s, 1H), 7.35 (s, 1H), 7.06 (s, 1H), 3.42 (m, 4H), 2.18 (s, 3H), 2.08 (s, 3H), 1.61 (m, 2H), 1.46 (m, 4H), 1.31 (s, 9H)。

用途實例



編號	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	logP(酸性)	logP(中性)
(A-1)	t-Bu	Me	Me	Et	2.02	
(A-2)	t-Bu	Me	Me	i-Pr	2.15	
(A-3)	t-Bu	Me	-(CH ₂) ₅ -		2.22	
(A-4)	t-Bu	CF ₃	-(CH ₂) ₅ -			
(A-5)	t-Bu	CF ₃	Me	Et		
(A-6)	t-Bu	CF ₃	Me	i-Pr		
(A-7)	t-Bu	Cl	Me	i-Pr		
(A-8)	t-Bu	Cl	Me	Et	2.11	
(A-9)	t-Bu	Cl	-(CH ₂) ₅ -		2.36	

實例 1：

白粉病菌(*Podosphaera*)試驗(蘋果)/保護性

溶劑： 24.5 份重之丙酮

24.5 份重之二甲基乙醯胺

5 乳化劑： 1 份重之烷基芳基聚甘醇醚

為配製一種適當的活性物質組成物，將 1 份重的 N-乙基-N-甲基-N'-[4-苯氧基-2,5-二甲苯基]甲脒(根據式(1))與所述量的溶劑及乳化劑混合，並將此濃縮物以水稀釋此至所要的濃度。

為試驗保護的有效性，以所給施用率之活性物質組成物噴灑幼年植物，待噴灑塗層乾燥後，植物被接種上蘋果白粉病菌(*Podosphaera leucotricha*)的孢子之水性懸浮液，再將植物移置於溫度約為 23°C 且相對濕度為約 70%之溫室中。

接種第 10 天後進行評估，此時，0%代表相當於對照組之有效性，而 100%有效性代表沒有感染。

實例 2：

白粉病(*Sphaerotheca*)試驗(黃瓜)/保護性

溶劑： 24.5 份重之丙酮

24.5 份重之二甲基乙醯胺

5 乳化劑： 1 份重之烷基芳基聚甘醇醚

為配製一種適當的活性物質組成物，將 1 份重的 N-乙基-N-甲基-N'-[4-苯氧基-2,5-二甲苯基]甲脒(根據式 I-a)與所述量的溶劑及乳化劑混合，並將此濃縮物以水稀釋此至所要的濃度。

為試驗保護的有效性，以所給施用率之活性物質組成物噴灑幼年植物，待噴灑塗層乾燥後，植物被接種上黃瓜白粉病菌(*Sphaerotheca fuliginea*)的孢子之水性懸浮液，再將植物移置於溫度約為 23°C 且相對濕度為約 70%之溫室中。

接種第 7 天後進行評估，此時，0%代表相當於對照組之有效性，而 100%有效性代表沒有感染。

實例 3：

單孢銹菌(*Uromyces*)試驗(豆子)/保護性

溶劑： 24.5 份重之丙酮

24.5 份重之二甲基乙醯胺

5 乳化劑： 1 份重之烷基芳基聚甘醇醚

為配製一種適當的活性物質組成物，將 1 份重的 N-乙基-N-甲基-N'-[4-苯氧基-2,5-二甲苯基]甲脒(根據式 I-a)與所述量的溶劑及乳化劑混合，並將此濃縮物以水稀釋此至所要的濃度。

為試驗保護的有效性，以所給施用率之活性物質組成物噴灑幼年植物，待噴灑塗層乾燥後，植物被接種上豆類銹病菌(*Uromyces appendiculatus*)的孢子水性懸浮液，置於約 20°C 及 100%相對濕度的培養箱內一天。

15 再將植物移置於溫度約為 21°C 且相對濕度為約 90%之溫室中。

接種 10 天後進行評估，此時，0%代表相當於對照組之有效性，而 100%有效性代表沒有感染。

實例 4：

白粉菌屬(*Erysiphe*)試驗(大麥)/保護性

溶劑： 49 份重之 N,N-二甲基甲醯胺

乳化劑： 1 份重之烷基芳基聚甘醇醚

5

為配製一種適當的活性物質組成物，將 1 份重的 N-乙基-N-甲基-N'-[4-苯氧基-2,5-二甲苯基]甲脒(根據式 I-a)與所述量的溶劑及乳化劑混合，並將此濃縮物以水稀釋此至所要的濃度。

10

為試驗保護的有效性，以所給施用率之活性物質組成物噴灑幼年的穀類植物，處理一天後，將植物接種上小麥白粉病菌(*Erysiphe graminis f. sp. Hordei*)的孢子，接著將植物移置於溫度為 18°C 且相對濕度為 70%之溫室中。

15

在接種第 7 天後進行評估，此時，0%代表相當於對照組之有效性，而 100%有效性代表沒有感染。

五、中文發明摘要：

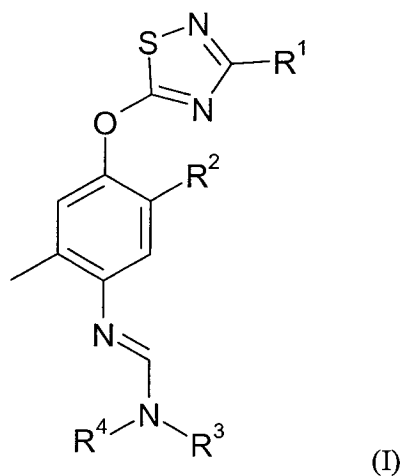
本發明關於具式(I)之噻二唑基氧苯基脒類、製備其之方法、使用根據本發明之脒類(amidines)用於對抗不想要的微生物之方法以及關於此目的之一種組成物，其係包含根據本發明之噻二唑基氧苯基脒類，本發明也關於一種供對抗不想要的微生物之方法，係藉由施用根據本發明之化合物至微生物及/或其生活環境。

六、英文發明摘要：

The present invention relates to thiadiazolyloxyphenylamidines of the general formula (I), to a process for the preparation thereof, to the use of the amidines according to the invention in combating undesirable microorganisms and to a composition for this purpose comprising the thiadiazolyloxyphenylamidines according to the invention. The invention furthermore relates to a method for combating undesirable microorganisms by application of the compounds according to the invention to the microorganisms and/or to the habitat thereof.

十、申請專利範圍：

1. 具式(I)之噻二唑基氧苯基脒類



其中

R^1 為第三-丁基，

R^2 為挑選自包括甲基、 C_{1-6} -鹵基烷基及鹵素之基，

R^3 為甲基，且

R^4 為挑選自包括乙基及異丙基之基，

或其中

R^4 及 R^3 與彼等被附接的氮原子，一起形成一種六氫吡啶基、吡咯啶基或 2,6-二甲基嗎啉基之基；

以及彼等之鹽類。

2. 根據申請專利第 1 項之噻二唑基氧苯基脒，其中

R^1 為第三-丁基，

R^2 為挑選自包括甲基、氯及三氟甲基，

R^3 為甲基，且

R^4 為挑選自包括乙基及異丙基之基，

或其中

R^4 及 R^3 與彼等被附接的氮原子一起形成一種六氫吡啶基、吡咯啶基或 2,6-二甲基嗎啉基之基，以及彼等之鹽類。

3. 根據申請專利第 1 或 2 項之噻二唑基氧苯基脒，其中

R^1 為第三-丁基，

R^2 為挑選自包括甲基及三氟甲基，

R^3 為甲基，且

R^4 為乙基，

或其中

R^4 及 R^3 與彼等被附接的氮原子一起形成一種六氫吡啶基，

以及彼等之鹽類。

4. 根據申請專利第 1 至 3 項中任一項之噻二唑基氧苯基脒，係挑選自包括下述化合物：

(A-1) N' -{4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-2,5-二甲基苯基}- N -乙基- N -甲基亞醯胺基甲醯胺；

(A-2) N' -{4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-2,5-二甲基苯基}- N -異丙基- N -甲基亞醯胺基甲醯胺；

(A-3) 4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-2,5-二甲基- N -[(1E)-六氫吡啶-1-基亞甲基]苯胺；

(A-4) 4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-2-甲基- N -[(1E)-六氫吡啶-1-基亞甲基]-5-(三氟甲基)

苯胺；

(A-5) N'-{4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-2-甲基-5-(三氟甲基)苯基}-N-乙基-N-甲基亞醯胺基甲醯胺；

(A-6) N'-{4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-2-甲基-5-(三氟甲基)苯基}-N-異丙基-N-甲基亞醯胺基甲醯胺；

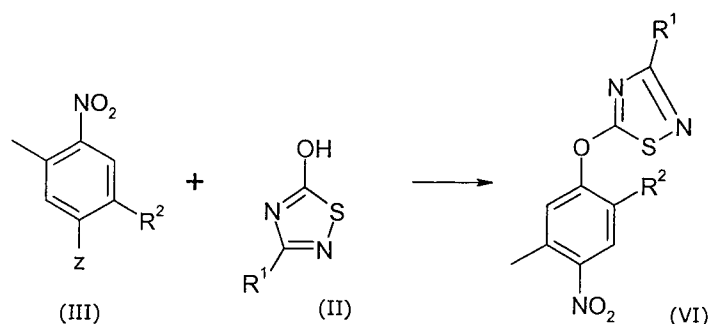
(A-7) N'-{4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-5-氯-2-甲基苯基}-N-異丙基-N-甲基亞醯胺基甲醯胺；

(A-8) N'-{4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-5-氯-2-甲基苯基}-N-乙基-N-甲基-亞醯胺基甲醯胺；

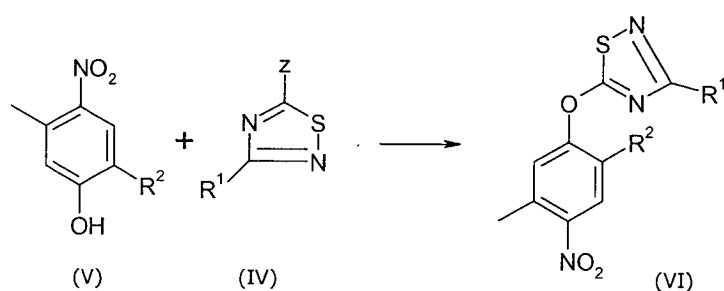
(A-9) 4-[(3-(第三-丁基)-1,2,4-噻二唑-5-基)氧]-5-氯-2-甲基-N-[(1E)-六氫吡啶-1-基亞甲基]苯胺。

5. 一種用於製備根據申請專利第 1 至 4 項中任一項之噻二唑基氧苯基脒類之方法，包含下述(a)至(j)之至少一種階段步驟：

(a) 根據下述之反應圖表，令式(III)的硝基苯衍生物類與具式(II)之一種噻二唑基醇反應：

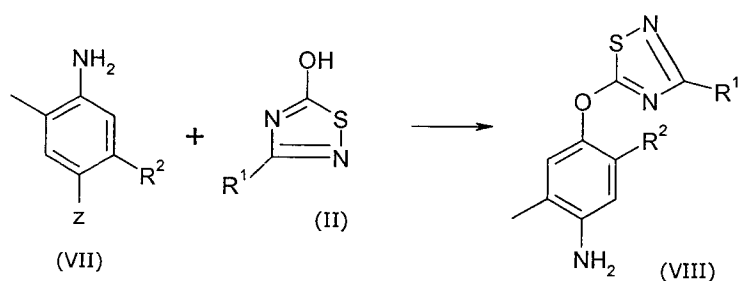


(b) 根據下述之反應圖表，令式(V)的硝基苯酚衍生物類與具式(IV)之噻二唑基衍生物類反應：

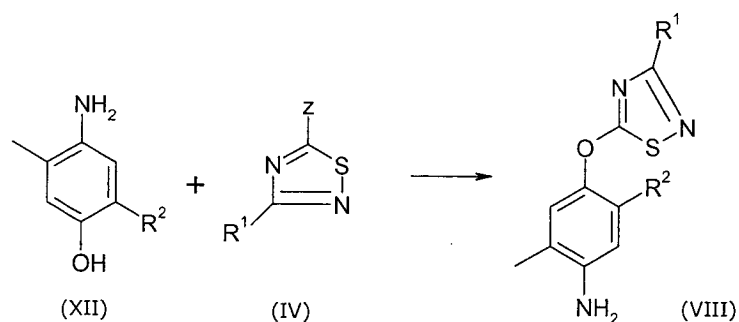


5

(c) 根據下述之反應圖表，令式(VII)的苯胺類與具式(II)之一種噻二唑基醇反應：

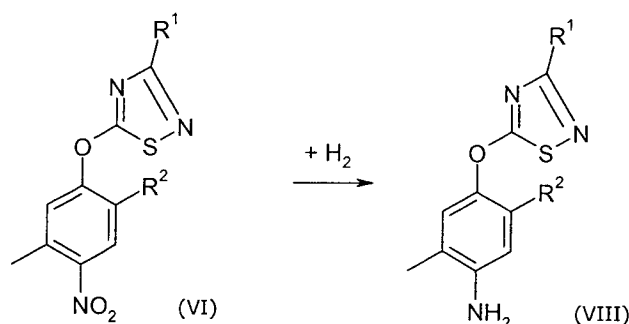


(d) 根據下述之反應圖表，令式(XII)的胺基苯酚類與具式(IV)的噻二唑基衍生物類反應：



10

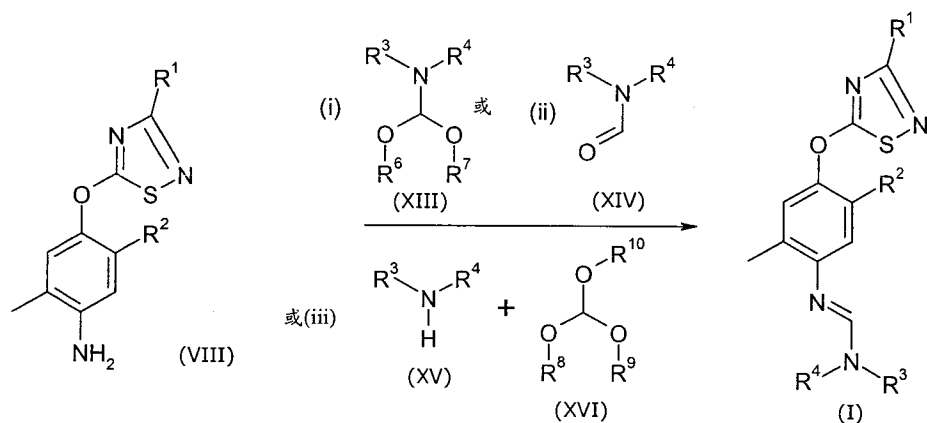
- (e) 根據下述之反應圖表，將式(VI)的硝基苯氧基噁類進行還原反應，製得具式(VIII)之苯胺噁類：



- (f) 令式(VIII)的苯胺噁類與以下的化合物

- (i) 具式(XIII)之胺基縮醛類，或
- (ii) 具式(XIV)之醯胺類，或
- (iii) 具式(XV)之胺類，在式(XVI)之正酯類(orthoesters)存在下

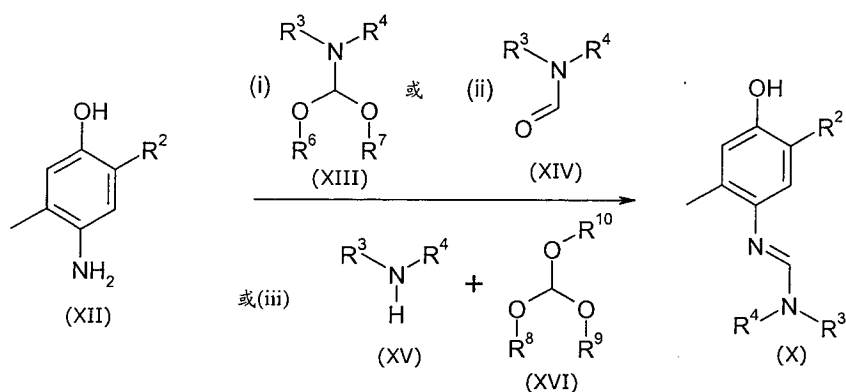
根據下述之反應圖表反應：



- (g) 令式(XII)的胺基苯酚類與以下的化合物

- (i) 具式(XIII)之胺基縮醛類，或
- (ii) 具式(XIV)之醯胺類，或
- (iii) 具式(XV)之胺類，在式(XVI)之正酯類(orthoesters)存在下

根據下述之反應圖表反應：



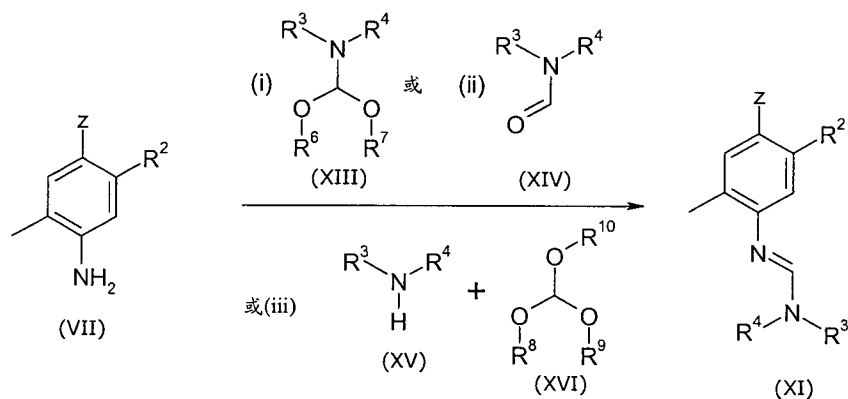
(h) 令式(VII)的胺基酚類與以下的化合物

(i) 具式(XIII)之胺基縮醛類，或

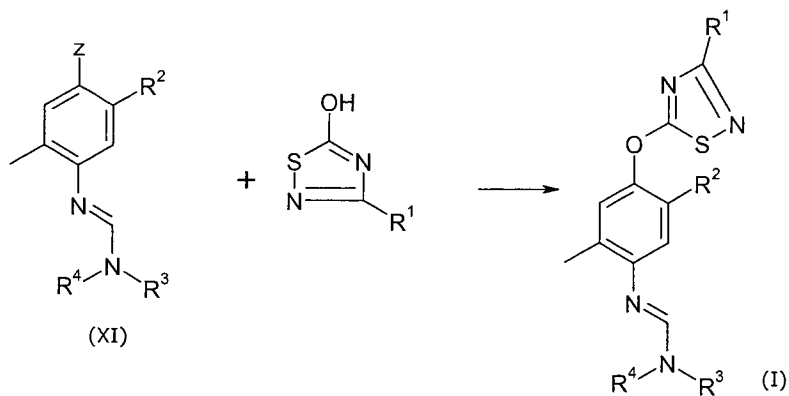
(ii) 具式(XIV)之醯胺類，或

(iii) 具式(XV)之胺類，在式(XVI)之正酯類存在下

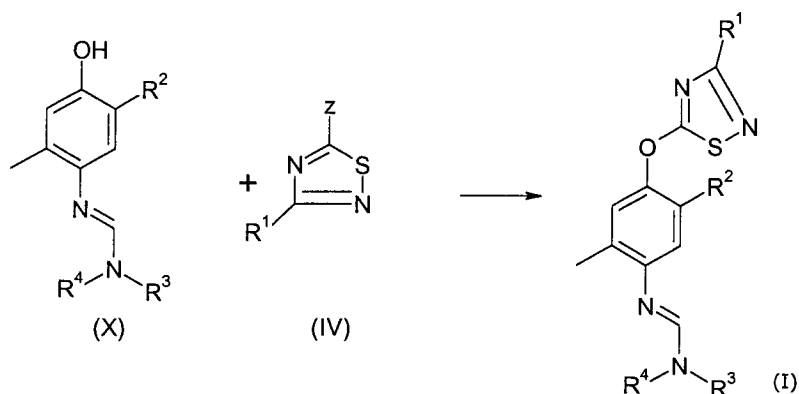
根據下述之反應圖表反應：



(i) 根據下述之反應圖表，令式(XI)的脘類與具式(II)的噻二唑基醇反應：



(j) 根據下述之反應圖表，令式(XI)的脒類與具式(IV)的噻二唑基衍生物類反應：



其中，於上述圖表中，

Z 為一種脫離基；

R¹ 至 R⁴ 具有前述之定義；

且

R⁶ 及 R⁷ 彼此獨立地為挑選自包括下述之基：氫、C₁₋₁₂-烷基、C₂₋₁₂-烯基、C₂₋₁₂-炔基、C₅₋₁₈-芳基及 C₇₋₁₉-芳基烷基，且可與彼等被附接的原子一起形成一種 5-、6-或 7-成員的環；

R⁸ 至 R¹⁰ 彼此獨立地為挑選自包括下述基：氫、C₁₋₁₂-烷基、C₂₋₁₂-烯基、C₂₋₁₂-炔基、C₅₋₁₈-芳基、C₇₋₁₉-芳基-烷基及 C₇₋₁₉-烷基芳基，且各情形下，R¹⁰ 與 R¹²、R¹⁰ 與 R¹¹ 或 R¹¹ 與 R¹² 可一起與彼等被附接的原子且適當的與另外的碳、氮、氧或硫原子，形成一種 5-、6-或 7-成員的環。

6. 一種用於對抗不想要的微生物之組成物，係包含至少

一種根據申請專利第 1 至 4 項中任一項之噻二唑基氧
苯基脒。

- 5
7. 一種根據申請專利第 1 至 4 項中任一項之噻二唑基氧
苯基脒或彼等之混合物用於對抗不想要的微生物之用
途。
8. 一種用於對抗不想要的微生物之方法，其特徵在於將
根據申請專利第 1 至 4 項中任一項之噻二唑基氧苯基
脒類施加至微生物及/或其生活環境。
9. 一種種子，其以至少一種根據申請專利第 1 至 4 項中
10 任一項之噻二唑基氧苯基脒處理過。
10. 一種根據申請專利第 1 至 4 項中任一項之噻二唑基氧
苯基脒類的用途，係用於處理種子。
11. 一種根據申請專利第 1 至 4 項中任一項之噻二唑基氧
苯基脒類的用途，係用於處理基因轉殖之植物。
12. 一種根據申請專利第 1 至 4 項中任一項之噻二唑基氧
15 苯基脒類的用途，係用於處理基因轉殖之植物的種子。
13. 一種供保護種子免於受到不想要的微生物影響之方
法，係藉由使用經至少一種根據申請專利第 1 至 4 項
中任一項之噻二唑基氧苯基脒處理過之種子。
- 20

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第（無）圖。

(二)本代表圖之元件符號簡單說明：

無

八、本案若有化學式時，請揭示最能顯示發明特徵的化學式：

