

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：1410287

※申請日期：94.2.3

※IPC 分類：C07C 233/66
C07D 231/4, 231/16, 327/06
A01N 43/56, 37/18

一、發明名稱：(中文/英文)

鹵烷基羧醯胺類

HALOALKYL CARBOXAMIDES

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. 包亞歷博士/DR. BADER, AXEL

2. 羅勃特博士/DR. KRIEG, ROBERT

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-Strasse 50, 40789 Monheim, Germany

國 籍：(中文/英文)

德國/Germany

三、發明人：(共 8 人)

姓 名：(中文/英文)

1. 杜洛夫/DUNKEL, RALF

2. 易漢斯/ELBE, HANS-LUDWIG

3. 哈賓特/HARTMANN, BENOIT

4. 葛朱格/GREUL, JOERG NICO

5. 易斯坦/ILG, KERSTIN

6.瓦優克/WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE

7.達彼得/DAHMEN, PETER

8.庫卡爾/KUCK, KARL-HEINZ

國 籍：(中文/英文)

1.~2.和 4.~8.均為德國/Germany

3.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，其事實發生日期為： 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：

德國;西元 2004 年 02 月 06 日; 102004005786.9

☐ 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。

6.瓦優克/WACHENDORFF-NEUMANN, ULRIKE

7.達彼得/DAHMEN, PETER

8.庫卡爾/KUCK, KARL-HEINZ

國 籍：(中文/英文)

1.~2.和 4.~8.均為德國/Germany

3.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，其事實發生日期為： 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：

德國;西元 2004 年 02 月 06 日; 102004005786.9

☐ 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】

本發明係關於新穎的鹵烷基羧醯胺類，製備其之許多方法及其供對抗不想要的微生物的用途。

5

【先前技術】

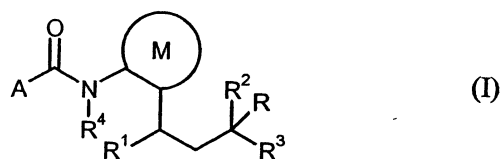
已知，有無數的羧醯胺類擁有殺真菌的性質(參考，例如，WO 03/010149，WO 02/059086，EP-A 0 824 099，EP-A 0 737 682，EP-A 0 591 699，EP-A 0 589 301，EP-A 0 545 099，DE-A 24 09 011，DE-A 20 06 472，JP-A 2001-302605，JP-A 10-251240，JP-A 8-176112，JP-A 8-92223 與 JP-A 53-72823)；於是，有無數的在烷基部位為無取代之烷基羧醯胺類成為已知化合物，例如，得知自 WO 02/059086 之 N-烯丙基-N-[2-(1,3-二甲基丁基)苯基]-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-羧醯胺，得知自 EP-A 0 824 099 之 N-[2-(1,3-二甲基丁基)-苯基]-2,4-二甲基-1,3-噻唑-5-羧醯胺與得知自 WO 03/010149 之 5-氟-1,3-二甲基-N-[2-(1,3,3-三甲基丁基)苯基]-1H-吡唑-4-羧醯胺，這些物質的有效性不錯，但其在某些情況仍有些不足，例如，在低施用比率下。

15

20

【發明內容】

已發現一類具式(I)之新穎的鹵基烷基羧醯胺類



5 其中

R 代表氫或鹵素，

R¹ 代表氫或甲基，

R² 代表甲基，乙基或具有1至9個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₄鹵基烷基，

10 R³ 代表鹵素或具有1至9個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₄鹵基烷基，

R⁴ 代表氫，C₁-C₈烷基，C₁-C₆烷基亞磺醯基，C₁-C₆烷基磺醯基，C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，C₃-C₈環烷基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₆鹵基烷基，C₁-C₄鹵基烷硫基，C₁-C₄鹵基烷基亞磺醯基，C₁-C₄鹵基烷基磺醯基，鹵基-C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之C₃-C₈鹵基環烷基；甲醯基，甲醯基-C₁-C₃-烷基，(C₁-C₃-烷基)羰基-C₁-C₃-烷基，(C₁-C₃-烷氧基)羰基-C₁-C₃-烷基；各具有1至13個氟，氯及/或溴原子之鹵基-(C₁-C₃烷基)羰基-C₁-C₃-烷基，鹵基-(C₁-C₃烷氧基)羰基-C₁-C₃-烷基；

20 (C₁-C₈烷基)羰基，(C₁-C₈烷氧基)羰基，(C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基)羰基，(C₃-C₈環烷基)羰基；各具有1

至9個氟，氯及/或溴原子之(C₁-C₆鹵基烷基)羰基，
(C₁-C₆鹵基烷氧基)羰基，(鹵基-C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄-
烷基)羰基，(C₃-C₈鹵基環烷基)羰基；或
-C(=O)C(=O)R⁵，-CONR⁶R⁷或-CH₂NR⁸R⁹，

5 R⁵ 代表氫，C₁-C₈烷基，C₁-C₈烷氧基，C₁-C₄-烷氧基
-C₁-C₄-烷基，C₃-C₈環烷基；各具有1至9個氟，氯
及/或溴原子之C₁-C₆鹵基烷基，C₁-C₆鹵基烷氧基，
鹵基-C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，C₃-C₈鹵基環烷基，
R⁶與R⁷彼此獨立地各代表氫，C₁-C₈烷基，C₁-C₄-烷氧基
10 C₁-C₄-烷基，C₃-C₈環烷基；各具有1至9個氟，氯及
/或溴原子之C₁-C₈鹵基烷基，鹵基-C₁-C₄-烷氧基
-C₁-C₄-烷基，C₃-C₈鹵基環烷基，

R⁶與R⁷另外，可與其附接的氮原子形成一種經取代的、飽
和的、具有5至8個環原子之雜環，帶有一或多個、
15 相同或相異的鹵素或C₁-C₄烷基之取代基，其中的
雜環可再含有1或2個、非相鄰的選自氧、硫或NR¹⁰
之雜原子，

R⁸與R⁹彼此獨立地代表氫，C₁-C₈-烷基，C₃-C₈環烷基；各
具有1至9個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₈鹵基烷基，
20 C₃-C₈鹵基環烷基，

R⁸與R⁹另外，可與其附接的氮原子形成一種經取代的、飽
和的、具有5至8個環原子之雜環，帶有一或多個、
相同或相異的鹵素或C₁-C₄烷基之取代基，其中的
雜環可再含有1或2個、非相鄰的選自氧、硫或NR¹⁰

之雜原子，

R^{10} 代表氫或 C_1-C_6 烷基，

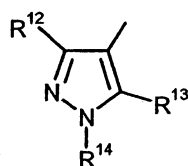
M 各情形下代表苯基，吡啶或嘧啶，具有單取代基 R^{11} 的噻吡或吡吡環或代表經 R^{11-A} 取代的噻唑環，

5 R^{11} 代表氫，氟，氯，甲基，異丙基，甲硫基或三氟甲基，

R^{11-A} 代表氫，甲基，甲硫基或三氟甲基，

A 代表式(A1)之基

10



(A1)，其中

15

R^{12} 代表氫，氰基，鹵素，硝基， C_1-C_4 烷基， C_1-C_4 烷氧基， C_1-C_4 烷硫基， C_3-C_6 環烷基，各具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_4 鹵基烷基， C_1-C_4 鹵基烷氧基或 C_1-C_4 鹵基烷硫基，胺基羰基或胺基羰基- C_1-C_4 -烷基，

R^{13} 代表氫，鹵素，氰基， C_1-C_4 烷基， C_1-C_4 烷氧基或 C_1-C_4 烷硫基，

20

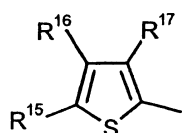
R^{14} 代表氫， C_1-C_4 烷基，羥基- C_1-C_4 烷基， C_2-C_6 烯基， C_3-C_6 環烷基， C_1-C_4 -烷硫基- C_1-C_4 -烷基， C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基，各具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_4 鹵基烷基， C_1-C_4 -鹵基烷硫基- C_1-C_4 -烷基， C_1-C_4 -鹵基烷氧基- C_1-C_4 -烷基，

或苯基，

或

A 代表式(A2)之基

5



(A2)，其中

R^{15} 與 R^{16} 彼此獨立地代表氫，鹵素， C_1 - C_4 烷基或具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

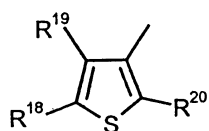
10

R^{17} 代表鹵素，氰基或 C_1 - C_4 烷基，或各具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基或 C_1 - C_4 鹵基烷氧基，

或

A 代表式(A3)之基

15



(A3)，其中

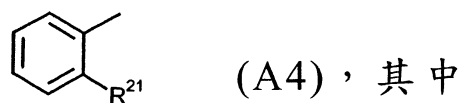
R^{18} 與 R^{19} 彼此獨立地代表氫，鹵素， C_1 - C_4 烷基或具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

20

R^{20} 代表氫，鹵素， C_1 - C_4 烷基或具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

或

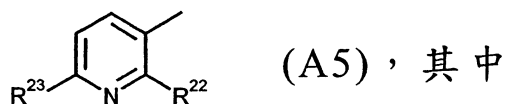
A 代表式(A4)之基



R^{21} 代表氫，鹵素，羥基，氰基， C_1 - C_6 烷基，各具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基， C_1 - C_4 鹵基烷氧基或 C_1 - C_4 鹵基烷硫基，

或

A 代表式(A5)之基

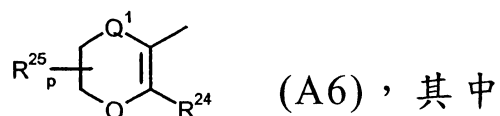


R^{22} 代表鹵素，羥基，氰基， C_1 - C_4 烷基， C_1 - C_4 烷氧基， C_1 - C_4 烷硫基，各具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基， C_1 - C_4 鹵基烷硫基或 C_1 - C_4 鹵基烷氧基，

R^{23} 代表氫，鹵素，氰基， C_1 - C_4 烷基， C_1 - C_4 烷氧基， C_1 - C_4 烷硫基，各具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基， C_1 - C_4 鹵基烷氧基， C_1 - C_4 烷基亞磺基或 C_1 - C_4 烷基磺基，

或

A 代表式(A6)之基



R^{24} 代表 C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

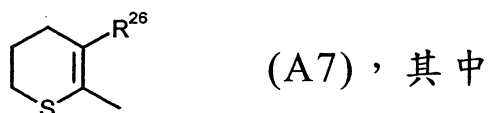
R^{25} 代表 C_1 - C_4 烷基，

Q^1 代表 S (硫)，O (氧)，SO，SO，或 CH_2 ，

5 p 代表 0，1 或 2，其中如果 p 為 2， R^{25} 代表相同或多種的基團，

或

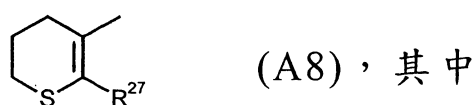
10 A 代表式 (A7) 之基



R^{26} 代表 C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子 C_1 - C_4 鹵基烷基，

或

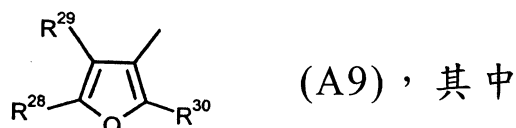
15 A 代表式 (A8) 之基



20 R^{27} 代表 C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

或

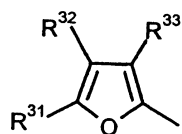
A 代表式 (A9) 之基



R^{28} 與 R^{29} 彼此獨立地代表氫，鹵素，胺基， C_1 - C_4 烷基或具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，
 R^{30} 代表氫，鹵素， C_1 - C_4 烷基或具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

5 或

A 代表式(A10)之基

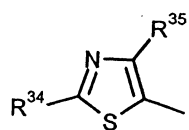


(A10)，其中

10 R^{31} 與 R^{32} 彼此獨立地代表氫，鹵素，胺基，硝基，
 C_1 - C_4 烷基或具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基
 烷基，
 R^{33} 代表氫，鹵素， C_1 - C_4 烷基或具有1至5個鹵素原
 子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

15 或

A 代表式(A11)之基

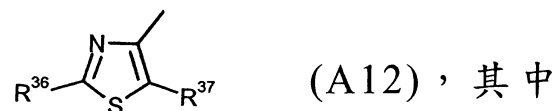


(A11)，其中

20 R^{34} 代表氫，鹵素，胺基， C_1 - C_4 烷基胺基，二- $(C_1$ - C_4
 烷基)胺基，氰基， C_1 - C_4 烷基或具有1至5個鹵
 素原子 C_1 - C_4 鹵基烷基，
 R^{35} 代表鹵素， C_1 - C_4 烷基或具有1至5個鹵素原子之
 C_1 - C_4 鹵基烷基，

或

A 代表式(A12)之基



5

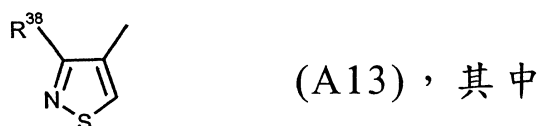
R^{36} 代表氫，鹵素，胺基， C_1 - C_4 烷基胺基，二- $(C_1$ - C_4 烷基)胺基，氰基， C_1 - C_4 烷基或具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

R^{37} 代表鹵素， C_1 - C_4 烷基或具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

10

或

A 代表式(A13)之基

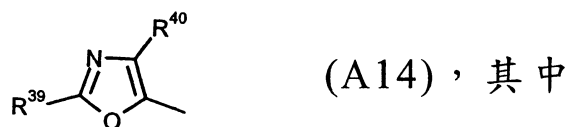


15

R^{38} 代表鹵素， C_1 - C_4 烷基或具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

或

A 代表式(A14)之基



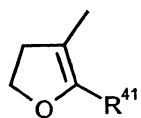
20

R^{39} 代表氫或 C_1 - C_4 烷基，

R^{40} 代表鹵素或 C_1 - C_4 烷基，

或

A 代表式(A15)之基



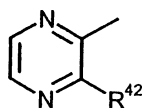
(A15)，其中

5

R^{41} 代表 C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

或

A 代表式(A16)之基



(A16)，其中

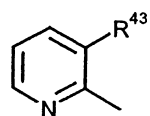
10

R^{42} 代表氫，鹵素， C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

15

或

A 代表式(A17)之基



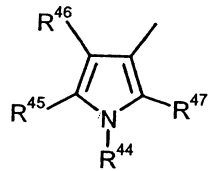
(A17)，其中

20

R^{43} 代表鹵素，羥基， C_1 - C_4 烷基， C_1 - C_4 烷氧基， C_1 - C_4 烷硫基，各具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基， C_1 - C_4 鹵基烷硫基或 C_1 - C_4 鹵基烷氧基，

或

A 代表式(A18)之基



(A18), 其中

5

R⁴⁴ 代表氫，氰基，C₁-C₄烷基，具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄鹵基烷基，C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄烷基，羥基-C₁-C₄烷基，C₁-C₄烷基磺醯基，二(C₁-C₄烷基)胺基磺醯基，C₁-C₆烷基羰基或各可經取代之苯基磺醯基或苯甲醯基，

10

R⁴⁵ 代表氫，鹵素，C₁-C₄烷基或具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄鹵基烷基，

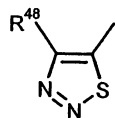
R⁴⁶ 代表氫，鹵素，氰基，C₁-C₄烷基或具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄鹵基烷基，

15

R⁴⁷ 代表氫，鹵素，C₁-C₄烷基或具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄鹵基烷基，

或

A 代表式(A19)之基



(A19), 其中

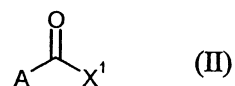
20

R⁴⁸ 代表C₁-C₄烷基。

此外，也發現，式(I)的鹵基烷基羧醯胺類可以得自，

藉由反應，式(I)的己基甲醯胺類可得自，令

a) 式(II)的羧酸衍生物類



5

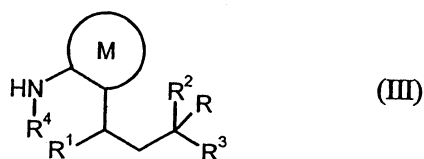
其中

A 具有的含義如前面的說明且

X^1 代表鹵素或羥基，

與式(III)的苯胺衍生物反應

10



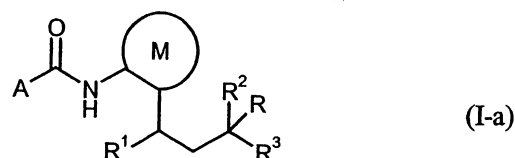
15

其中R， R^1 ， R^2 ， R^3 ， R^4 與M具有如前面界定的含義，可能地在催化劑存在下，可能地在縮合劑存在下，可能地在酸結合劑存在下及可能地在稀釋劑存在下進行，

或

b) 令式(I-a)之己基甲醯胺類

20



其中R， R^1 ， R^2 ， R^3 ，M與A具有上述說明的意義，

與式(IV)的鹵化物類反應



其中

X^2 代表氯，溴或碘，

R^{4-A} 代表 C_1-C_8 烷基， C_1-C_6 烷基亞磺醯基， C_1-C_6 烷基磺醯基， C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基， C_3-C_8 環烷基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之 C_1-C_6 鹵基烷基， C_1-C_4 鹵基烷硫基， C_1-C_4 鹵基烷基亞磺醯基， C_1-C_4 鹵基烷基磺醯基，鹵基- C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基， C_3-C_8 鹵基環烷基；甲醯基，甲醯基- C_1-C_3 -烷基，(C_1-C_3 -烷基)羰基- C_1-C_3 -烷基，(C_1-C_3 -烷氧基)羰基- C_1-C_3 -烷基；各具有1至13個氟，氯及/或溴原子之鹵基- C_1-C_3 -烷基)羰基- C_1-C_3 -烷基，鹵基-(C_1-C_3 烷氧基)羰基- C_1-C_3 -烷基；

(C_1-C_8 烷基)羰基，(C_1-C_8 烷氧基)羰基，(C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基)羰基，(C_3-C_8 環烷基)羰基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之(C_1-C_6 鹵基烷基)羰基，(C_1-C_6 鹵基烷氧基)羰基，(鹵基- C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基)羰基，(C_3-C_8 鹵基環烷基)羰基；或- $C(=O)C(=O)R^5$ ，- $CONR^6R^7$ 或- $CH_2NR^8R^9$ ，其中 R^5 ， R^6 ， R^7 ， R^8 與 R^9 具有已被說明之定義，

係在鹼存在下與稀釋介質存在下進行。

最後，已發現，式(I)之新穎的鹵基烷基羧醯胺類具有極佳的制微生物的性質且可被用於對抗不想要的微生物，供作物保護與材料保護兩方面之用途。

5 本發明的化合物可能呈其各式各樣的可能存在的異構物之混合物存在，特別是立體異構物類，例如，E-與Z-，threo-與 erythro-，以及光學異構物類與可應用的形式，此 E-與 Z-異構物類，threo-，erythro-，與光學異構物類及任何這些異構物的混合物以及可能的互變異構物都在本發明主張的範圍。

10 本發明以式(I)定義的一般鹵基烷基羧醯胺類中，在之前與後面的所給式中之較佳的基之定義如下，這些定義同樣適用於最後化合物以及全部的中間產物之定義。

R 適宜地代表氫，氟，氯或溴。

R 特別適宜地代表氫。

15 R 另外特別適宜地代表氟或氯。

R¹ 適宜地代表氫。

R¹ 另外適宜地代表甲基。

R² 適宜地代表甲基，乙基或各具單個或多個、相同或相異的氟，氯或溴為取代基之甲基，乙基，正-或異丙基，正-、異-、第二-或第三-丁基。

20 R² 特別適宜地代表甲基，乙基，三氟甲基，二氟甲基，氟甲基，三氯甲基，二氯甲基，氯甲基，氯氟甲基，氟二氯甲基，二氟氯甲基，五氟乙基，1-氟乙基，2-氟乙基，2,2-二氟乙基，2,2,2-三氟乙基，2-氯-2-氟乙

基，2-氯-2,2-二氟乙基，2-氯-2,2-二氟乙基，2,2-二氯-2-氟乙基，2,2,2-三氯乙基，1-氯丁基，七氟-正-丙基或七氟異丙基。

R^2 最特別適宜地代表甲基，乙基或三氟甲基。

5 R^2 尤其適宜地代表甲基。

R^2 另外尤其適宜地代表乙基。

R^2 另外尤其適宜地代表三氟甲基。

● R^3 適宜地代表氟，氯，溴，碘或各具單個或多個、相同或相異的氟，氯或溴為取代基之甲基，乙基，正-或異丙基，正-，異-，第二-或第三-丁基。

10 R^3 特別適宜地代表氟，氯，溴，三氟甲基，二氟甲基，氟甲基，三氯甲基，二氯甲基，氯甲基，氯氟甲基，氟二氯甲基，二氟氯甲基，五氟乙基，1-氟乙基，2-氟乙基，2,2-二氟乙基，2,2,2-三氟乙基，2-氯-2-氟乙基，2-氯-2,2-二氟乙基，2-氯-2,2-二氟乙基，2,2-二氯-2-氟乙基，2,2,2-三氯乙基，1-氯丁基，七氟-正-丙基或七氟異丙基。

R^3 最特別適宜地代表氯或三氟甲基。

R^3 尤其適宜地代表氯。

20 R^3 另外尤其適宜地代表三氟甲基。

R^4 適宜地代表氫， C_1 - C_6 烷基， C_1 - C_4 烷基亞磺醯基， C_1 - C_4 烷基磺醯基， C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基， C_3 - C_6 環烷基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基， C_1 - C_4 鹵基烷硫基， C_1 - C_4 鹵基烷基亞磺醯基， C_1 - C_4

鹵基烷基磺醯基，鹵基- C_1-C_3 -烷氧基- C_1-C_3 -烷基， C_3-C_8 鹵基環烷基；甲醯基，甲醯基- C_1-C_3 -烷基，(C_1-C_3 -烷基)羰基- C_1-C_3 -烷基，(C_1-C_3 -烷氧基)羰基- C_1-C_3 -烷基；各具有1至13個氟，氯及/或溴原子之鹵基-(C_1-C_3 烷基)羰基- C_1-C_3 -烷基，鹵基-(C_1-C_3 烷氧基)羰基- C_1-C_3 -烷基；

(C_1-C_6 烷基)羰基，(C_1-C_4 烷氧基)羰基，(C_1-C_3 -烷氧基- C_1-C_3 -烷基)羰基，(C_3-C_6 環烷基)羰基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之(C_1-C_4 鹵基烷基)羰基，(C_1-C_4 鹵基烷氧基)羰基，(鹵基- C_1-C_3 -烷氧基- C_1-C_3 -烷基)羰基，(C_3-C_6 鹵基環烷基)羰基；或- $C(=O)C(O)R^5$ ，- $CONR^6R^7$ 或- $CH_2NR^8R^9$ 。

R^4 特別適宜地代表氫，甲基，乙基，正-或異丙基，正-，異-，第二-或第三-丁基，戊基或己基，甲基亞磺醯基，乙基亞磺醯基，正-或異丙基亞磺醯基，正-，異-，第二-或第三-丁基亞磺醯基，甲基磺醯基，乙基磺醯基，正-或異丙基磺醯基，正-、異-、第二-或第三-丁基磺醯基，甲氧基甲基，甲氧基乙基，乙氧基甲基，乙氧基乙基，環丙基，環戊基，環己基，三氟甲基，三氯甲基，三氯乙基，二氟甲硫基，二氟氯甲硫基，三氟甲硫基，三氟甲基亞磺醯基，三氟甲基磺醯基，三氟甲氧基甲基；甲醯基，- CH_2-CHO ，- $(CH_2)_2-CHO$ ，- $CH_2-CO-CH_3$ ，- $CH_2-CO-CH_2CH_3$ ，- $CH_2-CO-CH(CH_3)_2$ ，- $(CH_2)_2-CO-CH_3$ ，

$-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$,
 $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$,
 $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CH}_3$,
 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$,
5 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CF}_3$,
 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CCl}_3$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CF}_3$,
 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CCl}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$,
 $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$,
 $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$,
10 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$,
 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$; 甲基羰基 , 乙基羰基 , 正-丙基羰基 , 異丙基羰基 , 第三-丁基羰基 , 甲氧基羰基 , 乙氧基羰基 , 第三-丁氧基羰基 , 環丙基羰基 ; 三氟
甲基羰基 , 三氟甲氧基羰基 , 或 $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{R}^5$,
15 $-\text{CONR}^6\text{R}^7$ 或 $-\text{CH}_2\text{NR}^8\text{R}^9$ 。

R^4 最特別適宜地代表 氫 , 甲基 , 甲氧基甲基 , 甲醯基 ,
 $-\text{CH}_2-\text{CHO}$, $-(\text{CH}_2)_2-\text{CHO}$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_3$,
 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CHO}$,
 $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(\text{O})\text{CH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{OCH}_3$,
20 $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_3$, $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 。

R^5 適宜地代表 氫 , C_1 - C_6 烷基 , C_1 - C_4 烷氧基 , C_1 - C_3 -烷
氧基- C_1 - C_3 -烷基 , C_3 - C_6 環烷基 ; 各具有 1 至 9 個 氟 ,
氯 及 / 或 溴 原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基 , C_1 - C_4 鹵基烷氧基 ,
鹵基- C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基 , C_3 - C_6 鹵基環烷基 。

R^5 特別適宜地代表氫，甲基，乙基，正-或異丙基，第三-丁基，甲氧基，乙氧基，正-或異丙氧基，第三-丁氧基，甲氧基甲基，環丙基；三氟-甲基，三氟甲氧基。

5 R^6 與 R^7 彼此獨立地適宜地代表氫， C_1 - C_6 烷基， C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基， C_3 - C_6 環烷基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，鹵基- C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基， C_3 - C_6 鹵基環烷基。

10 R^6 與 R^7 ，另外，適宜地與其附接的氮原子形成一種飽和的、經取代的5或6個環原子之雜環，其可經一至四個、相同或相異的鹵素或 C_1 - C_4 烷基取代，其中的雜環可再含有1或2個額外的，非鄰接的選自氧、硫或 NR^{10} 之雜原子。

15 R^6 與 R^7 彼此獨立地特別適宜地代表氫，甲基，乙基，正-或異丙基，正-、異-、第二-或第三-丁基，甲氧基甲基，甲氧基乙基，乙氧基甲基，乙氧基乙基，環丙基，環戊基，環己基；三氟甲基，三氯甲基，三氟乙基，三氟甲氧基甲基。

20 R^6 與 R^7 ，另外，特別適宜地與其附接的氮原子形成一種經取代的不飽和的雜環，其可經一至四個、相同或相異的氟，氯，溴或甲基之取代基取代，其中的雜環為一種嗎啉，硫嗎啉或六氫吡啶，其中的吡啶於第2個氮原子可再經 R^{10} 取代。

R^8 與 R^9 彼此獨立地適宜地代表氫， C_1 - C_6 烷基， C_3 - C_6 環烷

基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基， C_3 - C_6 鹵基環烷基。

R^8 與 R^9 ，另外，適宜地與其附接的氮原子形成一種飽和的、經取代的5或6個環原子之雜環，其可經一至四個、相同或相異的鹵素或 C_1 - C_4 烷基取代，其中的雜環可再含有1或2個額外的，非鄰接的選自氧、硫或 NR^{10} 之雜原子。

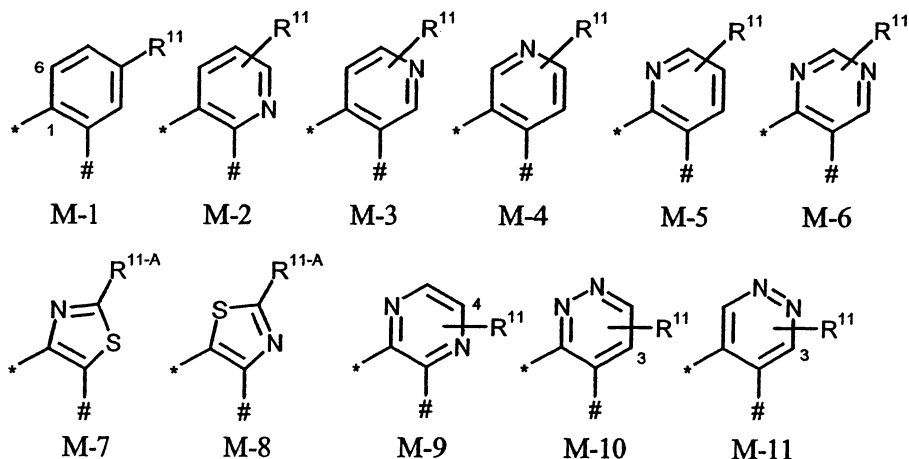
R^8 與 R^9 彼此獨立地特別適宜地代表氫，甲基，乙基，正-或異丙基，正-、異-、第二-或第三-丁基，甲氧基甲基，甲氧基乙基，乙氧基甲基，乙氧基乙基，環丙基，環戊基，環己基；三氟甲基，三氯甲基，三氟乙基，三氟甲氧基甲基。

R^8 與 R^9 ，另外，特別適宜地與其附接的氮原子形成一種經取代的不飽和的雜環，其可經一至四個、相同或相異的氟，氯，溴或甲基之取代基取代，其中的雜環為一種嗎啉，硫嗎啉或六氫吡啶，其中的吡啶於第2個氮原子可再經 R^{10} 取代。

R^{10} 適宜地代表氫或 C_1 - C_4 烷基。

R^{10} 特別適宜地代表氫，甲基，乙基，正-或異丙基，正-、異-、第二-或第三-丁基。

M 適宜地代表下列環之一



其中以星號("*")標示的鍵係與鹽胺相連，而以"#"標示的鍵則係連至鹵基烷基之基團。

M 特別適宜地代表選自下列之環：M-1，M-2，M-3，M-6，M-7與M-8。

M 最特別適宜地代表M-1環。

M 另外最特別適宜地代表雜環M-2。

M 另外最特別適宜地代表雜環M-3。

M 另外最特別適宜地代表雜環M-6。

M 另外最特別適宜地代表雜環M-7。

M 另外最特別適宜地代表雜環M-8。

R¹¹ 適宜地代表氫，氟，氯，甲基或三氟甲基。

R¹¹ 最特別適宜地代表氫或氯。

R¹¹ 在M代表M-2，M-3，M-4或M-5的情況下，另外適宜地代表氯，其中的氯特別適宜地位於6-位置(M-2，M-3)或位於3-位置(M-4，M-5)。

R¹¹ 在M代表M-2，M-3，M-4或M-5的情況下，另外適宜地代表氯，其中的氯特別適宜地位於6-位置(M-2，

M-3)或位於3-位置(M-4, M-5)。

R¹¹ 在M代表M-2, M-3, M-4或M-5的情況下, 另外適宜地代表甲基, 其中的甲基特別適宜地位於4-位置(M-2)或位於3-位置(M-3, M-4, M-5)。

5 R¹¹ 在M代表M-6的情況下, 另外適宜地代表甲基, 其中的甲基特別適宜地位於3-位置。

R¹¹ 在M代表M-6的情況下, 另外適宜地代表三氟甲基, 其中的三氟甲基特別適宜地位於3-位置。

10 R¹¹ 在M代表M-9的情況下, 另外適宜地代表甲基, 其中的甲基特別適宜地位於4-位置。

R¹¹ 在M代表M-9的情況下, 另外適宜地代表三氟甲基, 其中的三氟甲基特別適宜地位於4-位置。

R¹¹ 在M代表M-10的情況下, 另外適宜地代表甲基, 其中的甲基特別適宜地位於3-位置。

15 R¹¹ 在M代表M-10的情況下, 另外適宜地代表三氟甲基, 其中的三氟甲基特別適宜地位於3-位置。

R¹¹ 在M代表M-11的情況下, 另外適宜地代表甲基, 其中的甲基特別適宜地位於3-位置。

20 R¹¹ 在M代表M-11的情況下, 另外適宜地代表三氟甲基, 其中的三氟甲基特別適宜地位於3-位置。

R^{11-A} 適宜地代表氫。

R^{11-A} 另外適宜地代表甲基。

R^{11-A} 另外適宜地代表三氟甲基。

A 適宜地代表下列基之一: A1, A2, A3, A4, A5, A6,

A9, A10, A11, A12, A16或A17。

A 特別適宜地代表下列基之一: A1, A2, A3, A4, A5, A6, A9, A11, A16, A17, A18。

A 最特別適宜地代表A1基。

5 A 另外最特別適宜地代表A2基。

A 另外最特別適宜地代表A3基。

A 另外最特別適宜地代表A4基。

A 另外最特別適宜地代表A5基。

A 另外最特別適宜地代表A6基。

10 A 另外最特別適宜地代表A9基。

A 另外最特別適宜地代表A11基。

A 另外最特別適宜地代表A16基。

A 另外最特別適宜地代表A17基。

A 另外最特別適宜地代表A18基。

15 R¹² 適宜地代表氫, 氟基, 氟, 氯, 溴, 碘, 甲基, 乙基, 異丙基, 甲氧基, 乙氧基, 甲硫基, 乙硫基, 環丙基, 具有1至5個氟, 氯 及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基, C₁-C₂鹵基烷氧基, 三氟甲硫基, 二氟甲硫基, 胺基羰基, 胺基羰基甲基或胺基羰基乙基。

20 R¹² 特別適宜地代表氫, 氟, 氯, 溴, 碘, 甲基, 乙基, 異丙基, 單氟甲基, 單氟乙基, 二氟甲基, 三氟甲基, 二氟氯甲基, 三氯甲基, 二氯甲基, 環丙基, 甲氧基, 乙氧基, 三氟甲氧基, 三氯甲氧基, 甲硫基, 乙硫基, 三氟甲硫基或二氟甲硫基。

- R¹² 最特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，甲基，異丙基，單氟甲基，單氟乙基，二氟甲基，三氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。
- 5 R¹² 尤其適宜地代表甲基，二氟甲基，三氟甲基或1-氟乙基。
- R¹³ 特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，甲基，乙基，甲氧基，乙氧基，甲硫基或乙硫基。
- R¹³ 特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘或甲基。
- R¹³ 最特別適宜地代表氫，氟，氯，或甲基。
- 10 R¹⁴ 適宜地代表氫，甲基，乙基，正-丙基，異丙基，具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基，羥基甲基，羥基乙基，環丙基，環戊基，環己基或苯基。
- R¹⁴ 特別適宜地代表氫，甲基，乙基，異丙基，三氟甲基，二氟甲基，羥基甲基，羥基乙基或苯基。
- 15 R¹⁴ 最特別適宜地代表氫，甲基，三氟甲基或苯基。
- R¹⁴ 尤其適宜地代表甲基。
- R¹⁵與R¹⁶彼此獨立地代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。
- R¹⁵與R¹⁶彼此獨立地代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基，二氟甲基，三氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。
- 20 R¹⁵與R¹⁶彼此獨立地最特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基，二氟甲基，三氟甲基或三氯甲基。
- R¹⁵與R¹⁶尤其適宜地各代表氫。
- R¹⁷ 適宜地代表氟，氯，溴，氰基，甲基，乙基，C₁-C₂

鹵基烷基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷氧基。

R¹⁷ 特別適宜地代表氟，氯，溴，氟基，甲基，三氟甲基，三氟甲氧基，二氟甲氧基，二氟氯甲氧基或三氯甲氧基。

R¹⁷ 最特別適宜地代表氟，氯，溴，碘，甲基，三氟甲基或三氟甲氧基。

R¹⁷ 尤其適宜地代表甲基。

R¹⁸與R¹⁹彼此獨立地適宜地代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

R¹⁸與R¹⁹彼此獨立地特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基，二氟甲基，三氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。

R¹⁸與R¹⁹彼此獨立地特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基，二氟甲基，三氟甲基或三氯甲基。

R¹⁸與R¹⁹ 尤其適宜地各代表氫。

R²⁰ 適宜地代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

R²⁰ 特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，甲基或三氟甲基。

R²⁰ 最特別適宜地代表甲基。

R²¹ 適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，羥基，氟基，C₁-C₄烷基，各具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基

烷基，C₁-C₂鹵基烷氧基或C₁-C₂鹵基烷硫基。

5 R²¹ 特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，羥基，氰基，
甲基，乙基，正-丙基，異丙基，正-丁基，異-丁基，
第二-丁基，第三-丁基，二氟甲基，三氟甲基，二氟
氯甲基，三氯甲基，三氟甲氧基，二氟甲氧基，二氟
氯甲氧基，三氯甲氧基，三氟甲硫基，二氟甲硫基，
二氟氯甲硫基或三氯甲硫基。

● R²¹ 最特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，甲基，二氟
甲基，三氟甲基或三氯甲基。

10 R²¹ 尤其適宜地代表碘，甲基，二氟甲基或三氟甲基。

R²² 適宜地代表氟，氯，溴，碘，羥基，氰基，C₁-C₄烷
基，甲氧基，乙氧基，甲硫基，乙硫基，二氟甲硫基，
三氟甲硫基，各具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂
鹵基烷基或C₁-C₂鹵基烷氧基。

15 R²² 特別適宜地代表氟，氯，溴，碘，羥基，氰基，甲基，
乙基，正-丙基，異丙基，正-丁基，異-丁基，第二-
丁基，第三-丁基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲
基，三氯甲基，甲氧基，乙氧基，甲硫基，乙硫基，
二氟甲硫基，三氟甲硫基，三氟甲氧基，二氟甲氧基，
二氟氯甲氧基或三氯甲氧基。

20 R²² 最特別適宜地代表氟，氯，溴，碘，甲基，三氟甲基，
二氟甲基或三氯甲基。

R²³ 適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，氰基，C₁-C₄烷基，
甲氧基，乙氧基，甲硫基，乙硫基，各具有1至5個氟，

氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基或C₁-C₂鹵基烷氧基，C₁-C₂烷基亞磺醯基或C₁-C₂烷基磺醯基。

5 R²³ 特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，氰基，正-丙基，異丙基，正-丁基，異-丁基，第二-丁基，第三-丁基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基，三氯甲基，甲氧基，乙氧基，甲硫基，乙硫基，三氟甲氧基，二氟甲氧基，二氟氯甲氧基，三氯甲氧基，甲基亞磺醯基或甲基磺醯基。

10 R²³ 最特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，正-丙基，異丙基，n-丁基，異-丁基，第二-丁基，第三-丁基，三氟甲基，二氟甲基，三氯甲基，甲基亞磺醯基或甲基磺醯基。

R²³ 尤其適宜地代表氫。

15 R²⁴ 適宜地代表甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

R²⁴ 特別適宜地代表甲基，乙基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。

R²⁵ 適宜地代表甲基或乙基。

R²⁵ 特別適宜地代表甲基。

20 Q¹ 適宜地代表S (硫)，SO₂或CH₂。

Q¹ 特別適宜地代表S (硫)或CH₂。

Q¹ 最特別適宜地代表S (硫)。

p 適宜地代表0或1。

p 特別適宜地代表0。

R²⁶ 適宜地代表甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

R²⁶ 特別適宜地代表甲基，乙基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。

5 R²⁶ 最特別適宜地代表甲基，三氟甲基，二氟甲基或三氯甲基。

R²⁷ 適宜地代表甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

R²⁷ 特別適宜地代表甲基，乙基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。

10 R²⁷ 最特別適宜地代表甲基，三氟甲基，二氟甲基或三氯甲基。

R²⁸與R²⁹彼此獨立地適宜地代表氫，氟，氯，溴，胺基，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

15 R²⁸與R²⁹彼此獨立地特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。

R²⁸與R²⁹彼此獨立地最特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，甲基，三氟甲基，二氟甲基或三氯甲基。

20 R²⁸與R²⁹尤其適宜地各代表氫。

R³⁰ 適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

R³⁰ 特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，甲基，乙基，

三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。

R³⁰ 最特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，甲基，三氟甲基，
二氟甲基或三氯甲基。

R³⁰ 尤其適宜地代表甲基。

5 R³¹與R³²彼此獨立地適宜地代表氫，氟，氯，溴，胺基，
硝基，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子
之C₁-C₂鹵基烷基。

R³¹與R³²彼此獨立地特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，硝
基，甲基，乙基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基
10 或三氯甲基。

R³¹與R³²彼此獨立地最特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，
甲基，三氟甲基，二氟甲基或三氯甲基。

R³¹與R³² 尤其適宜地各代表氫。

15 R³³ 適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，甲基，乙基或具有
1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

R³³ 特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，甲基，乙基，
三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。

R³³ 最特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，甲基，三氟甲基，
二氟甲基或三氯甲基。

20 R³³ 尤其適宜地代表甲基。

R³⁴ 適宜地代表氫，氟，氯，溴，胺基，C₁-C₄烷基胺基，
二(C₁-C₄烷基)胺基，氰基，甲基，乙基或具有1至5
個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

R³⁴ 特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，胺基，甲基胺基，

二甲基胺基，氰基，甲基，乙基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。

R³⁴ 最特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，胺基，甲基胺基，二甲基胺基，甲基，三氟甲基，二氟甲基或三氯甲基。

5 R³⁴ 尤其適宜地代表胺基，甲基胺基，二甲基胺基，甲基或三氟甲基。

R³⁵ 適宜地代表氟，氯，溴，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

10 R³⁵ 特別適宜地代表氟，氯，溴，甲基，乙基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。

R³⁵ 最特別適宜地代表氟，氯，溴，甲基，三氟甲基，二氟甲基或三氯甲基。

R³³ 尤其適宜地代表甲基，三氟甲基或二氟甲基。

15 R³⁶ 適宜地代表氫，氟，氯，溴，胺基，C₁-C₄烷基胺基，二(C₁-C₄烷基)胺基，氰基，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

R³⁶ 特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，胺基，甲基胺基，二甲基胺基，氰基，甲基，乙基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。

20 R³⁶ 最特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，胺基，甲基胺基，二甲基胺基，甲基，三氟甲基，二氟甲基或三氯甲基。

R³⁶ 尤其適宜地代表胺基，甲基胺基，二甲基胺基，甲基或三氟甲基。

R³⁷ 適宜地代表氟，氯，溴，甲基，乙基或具有1至5個氟，

氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

R³⁷ 特別適宜地代表氟，氯，溴，甲基，乙基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。

R³⁷ 最特別適宜地代表氟，氯，溴，甲基，三氟甲基，二氟甲基或三氯甲基。

R³⁷ 尤其適宜地代表甲基，三氟甲基或二氟甲基。

R³⁸ 適宜地代表氟，氯，溴，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

R³⁸ 特別適宜地代表氟，氯，溴，甲基，乙基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。

R³⁸ 最特別適宜地代表氟，氯，溴，甲基，三氟甲基，二氟甲基或三氯甲基。

R³⁹ 適宜地代表氫，甲基或乙基。

R³⁹ 特別適宜地代表甲基。

R⁴⁰ 適宜地代表氟，氯，溴，甲基或乙基。

R⁴⁰ 特別適宜地代表氟，氯，或甲基。

R⁴¹ 適宜地代表甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

R⁴¹ 特別適宜地代表甲基，乙基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。

R⁴¹ 最特別適宜地代表甲基，三氟甲基，二氟甲基或三氯甲基。

R⁴¹ 尤其適宜地代表甲基或三氟甲基。

R⁴² 適宜地代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基或具有1至5

個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

R⁴² 特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，甲基或三氟甲基。

R⁴³ 適宜地代表氟，氯，溴，碘，羥基，C₁-C₄烷基，甲氧基，乙氧基，甲硫基，乙硫基，二氟甲硫基，三氟甲硫基，各具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基或C₁-C₂鹵基烷氧基。

R⁴³ 特別適宜地代表氟，氯，溴，碘，甲基，乙基，正-丙基，異丙基，正-丁基、異-丁基、第二-丁基、第三-丁基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。

R⁴³ 最特別適宜地代表氟，氯，溴，碘，甲基，三氟甲基，二氟甲基或三氯甲基。

R⁴⁴ 適宜地代表氫，甲基，乙基，具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基，C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄-烷基，羥基甲基，羥基乙基，甲基磺醯基或二甲基胺基磺醯基。

R⁴⁴ 特別適宜地代表氫，甲基，乙基，三氟甲基，甲氧基甲基，乙氧基甲基，羥基甲基或羥基乙基。

R⁴⁴ 最特別適宜地代表甲基或甲氧基甲基。

R⁴⁵ 適宜地代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基或各具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基。

R⁴⁵ 特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基，三氟甲基，二氟甲基，或三氯甲基。

R⁴⁵ 最特別適宜地代表氫或甲基。

R^{46} 適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，氰基，甲基，乙基，異丙基或各具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基。

R^{46} 特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，氰基，甲基，乙基，異丙基，三氟甲基，二氟甲基，二氟氯甲基或三氯甲基。

R^{46} 最特別適宜地代表氫，甲基，二氟甲基或三氟甲基。

R^{47} 適宜地代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基。

R^{47} 特別適宜地代表氫，氟，氯，溴，碘，甲基或三氟甲基。

R^{47} 最特別適宜地代表氫。

R^{48} 適宜地代表甲基，乙基，正-丙基或異丙基。

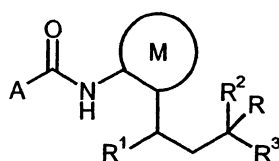
R^{48} 特別適宜地代表甲基或乙基。

較適合的具體實例為那些式(I)的化合物，其中所有的基為在各情況下具有上述較適宜的定義者。

特別適合的具體實例為那些式(I)的化合物，其中所有的基為在各情況下具有上述特別適宜的定義者。

下述種類的新穎的羧醯胺為較適宜者且可被認為是相關於引述如上述的式(I)化合物之子集：

第1類：式(I-a)之鹵基烷基羧醯胺類

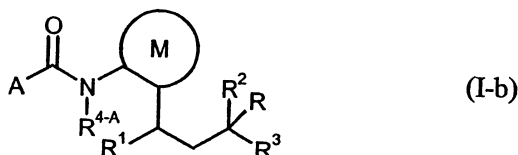


(I-a)

其中 R ， R^1 ， R^2 ， R^3 ， M 與 A 具有如上述說明的含義。

第2類：式(I-b)之鹵基烷基羧醯胺類

5



其中 R ， R^1 ， R^2 ， R^3 ， R^{4-A} ， M 與 A 具有如上述說明的含義。

10

R^{4-A} 適宜地代表 C_1 - C_6 烷基， C_1 - C_4 烷基亞磺醯基， C_1 - C_4 烷基磺醯基， C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基， C_3 - C_6 環烷基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基， C_1 - C_4 鹵基烷硫基， C_1 - C_4 鹵基烷基亞磺醯基， C_1 - C_4 鹵基烷基磺醯基，鹵基- C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基， C_3 - C_8 鹵基環烷基；甲醯基，甲醯基- C_1 - C_3 -烷基，(C_1 - C_3 烷基)羰基- C_1 - C_3 -烷基，(C_1 - C_3 烷氧基)羰基- C_1 - C_3 -烷基；各具1至13個氟，氯及/或溴原子之鹵基-(C_1 - C_3 烷基)羰基- C_1 - C_3 -烷基，鹵基-(C_1 - C_3 烷氧基)羰基- C_1 - C_3 -烷基；

15

20

(C_1 - C_6 烷基)羰基，(C_1 - C_4 烷氧基)羰基，(C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基)羰基，(C_3 - C_6 環烷基)羰基；各具1至9個氟，氯及/或溴原子之(C_1 - C_4 鹵基烷基)羰基，(C_1 - C_4 鹵基烷氧基)羰基，(鹵基- C_1 - C_3 -烷氧基- C_1 - C_3 -烷基)羰基，(C_3 - C_6 鹵基環烷基)羰基；或 $-C(=O)C(=O)R^5$ ，

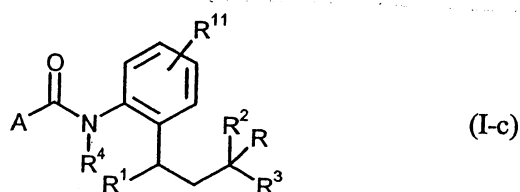
-CONR⁶R⁷或-CH₂NR⁸R⁹。

R^{4-A} 特別適宜地代表甲基，乙基，正-或異丙基，正-、異-、第二-或第三-丁基，戊基或己基，甲基亞磺醯基，乙基亞磺醯基，正-或異丙基亞磺醯基，正-、異-、第二-或第三-丁基亞磺醯基，甲基磺醯基，乙基磺醯基，正-或異丙基磺醯基，正-、異-、第二-或第三-丁基磺醯基，甲氧基甲基，甲氧基乙基，乙氧基甲基，乙氧基乙基，環丙基，環戊基，環己基，三氟甲基，三氟乙基，二氟甲硫基，二氟氯甲硫基，三氟甲硫基，三氟甲基亞磺醯基，三氟甲基磺醯基，三氟甲氧基甲基； 甲醯基，-CH₂-CHO，-(CH₂)₂-CHO，-CH₂-CO-CH₃，-CH₂-CO-CH₂CH₃，-CH₂-CO-CH(CH₃)₂，-(CH₂)₂-CO-CH₃，-(CH₂)₂-CO-CH₂CH₃，-(CH₂)₂-CO-CH(CH₃)₂，-CH₂-CO₂CH₃，-CH₂-CO₂CH₂CH₃，-CH₂-CO₂CH(CH₃)₂，-(CH₂)₂-COCCl₃，-(CH₂)₂-CO₂CH₂CH₃，(CH₂)₂-CO₂CH(CH₃)₂，-CH₂-CO-CF₃，-CH₂-CO-CCl₃，-CH₂-CO-CH₂CF₃，-CH₂-CO-CH₂CCl₃，-(CH₂)₂-CO-CH₂CF₃，-(CH₂)₂-CO-CH₂CCl₃，-CH₂-CO₂CH₂CF₃，-CH₂-CO₂CF₂CF₃，-CH₂-CO₂CH₂CCl₃，-CH₂-CO₂CCl₂CCl₃，-(CH₂)₂-CO₂CH₂CF₃，-(CH₂)₂-CO₂CF₂CF₃，-(CH₂)₂-CO₂CH₂CCl₃，-(CH₂)₂-CO₂CCl₂CCl₃； 甲基羰基，乙基羰基，正-丙

基羰基，異丙基羰基，第三-丁基羰基，甲氧基羰基，乙氧基羰基，第三-丁氧基羰基，環丙基羰基；三氟甲基羰基，三氟甲氧基羰基，或 $-C(=O)C(=O)R^5$ ， $-CONR^6R^7$ 或 $-CH_2NR^8R^9$ 。

- 5 R^{4-A} 最特別適宜地代表甲基，甲氧基甲基，甲醯基，
 $-CH_2-CHO$ ， $-(CH_2)_2-CHO$ ， $-CH_2-CO-CH_3$ ，
 $-CH_2-CO-CH_2CH_3$ ， $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$ ，
 $-C(=O)CHO$ ， $-C(=O)C(=O)CH_3$ ，
 $-C(=O)C(=O)CH_2OCH_3$ ， $-C(=O)CO_2CH_3$ ，
10 $-C(=O)CO_2CH_2CH_3$ 。

第3類：式(I-c)之鹵基烷基羧醯胺類



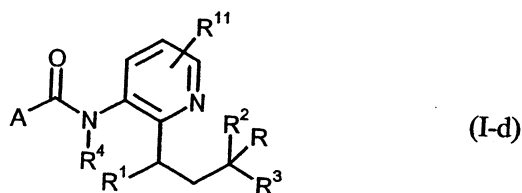
其中 R ， R^1 ， R^2 ， R^3 ， R^4 ， R^{11} 與 A 具有如上述說明的含義。

較適當的式(I-c)之具體實例為其中 R^4 代表氫之鹵基烷基羧醯胺類。

20 較適當的式(I-c)之具體實例為其中 R^{11} 代表氫之鹵基烷基羧醯胺類。

較適當的式(I-c)之具體實例為其中 R^4 與 R^{11} 各代表氫之鹵基烷基羧醯胺類。

第 4 類：式(I-d)之鹵基烷基羧醯胺類



5

其中R，R¹，R²，R³，R⁴，R¹¹與A具有如上述說明的含義。

較適當的式(I-d)之具體實例為其中 R⁴ 代表氫之鹵基烷基羧醯胺類。

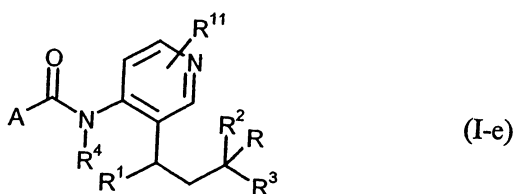
10

較適當的式(I-d)之具體實例為其中 R¹¹ 代表氫之鹵基烷基羧醯胺類。

較適當的式(I-d)之具體實例為其中 R⁴ 與 R¹¹ 各代表氫之鹵基烷基羧醯胺類。

15

第5類：式(I-e)之鹵基烷基羧醯胺類



20

其中R，R¹，R²，R³，R⁴，R¹¹與A具有如上述說明的含義。

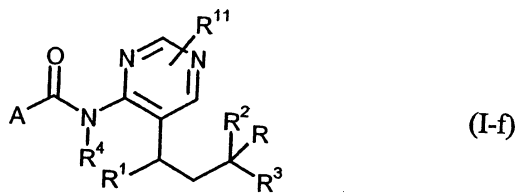
較適當的式(I-e)之具體實例為其中 R⁴ 代表氫之鹵基烷基羧醯胺類。

較適當的式(I-e)之具體實例為其中 R¹¹ 代表氫之鹵基

烷基羧醯胺類。

較適當的式(I-e)之具體實例為其中 R^4 與 R^{11} 各代表氫之鹵基烷基羧醯胺類。

5 第6類：式(I-f)之鹵基烷基羧醯胺類



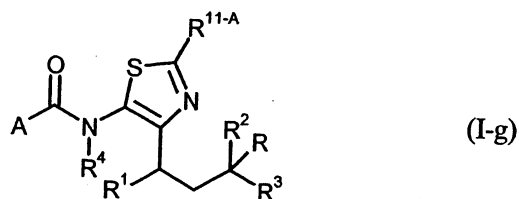
10 其中 R , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^{11} 與 A 具有如上述說明的含義。

較適當的式(I-f)之具體實例為其中 R^4 代表氫之鹵基烷基羧醯胺類。

15 較適當的式(I-f)之具體實例為其中 R^{11} 代表氫之鹵基烷基羧醯胺類。

較適當的式(I-f)之具體實例為其中 R^4 與 R^{11} 各代表氫之鹵基烷基羧醯胺類。

第7類：式(I-g)之鹵基烷基羧醯胺類



20 其中 R , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^{11-A} 與 A 具有如上述說

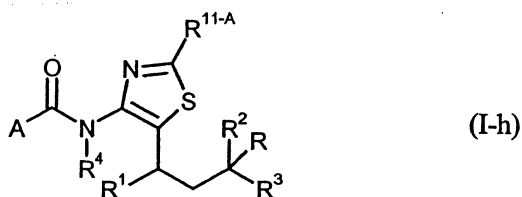
明的含義。

較適當的式(I-g)之具體實例為其中 R^4 代表氫之鹵基烷基羧醯胺類。

較適當的式(I-g)之具體實例為其中 R^{11} 代表氫之鹵基
5 烷基羧醯胺類。

較適當的式(I-g)之具體實例為其中 R^4 與 R^{11} 各代表氫之鹵基烷基羧醯胺類。

第8類：式(I-h)之鹵基烷基羧醯胺類



其中 R , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^{11-A} 與 A 具有如上述說
15 明的含義。

較適當的式(I-h)之具體實例為其中 R^4 代表氫之鹵基
20 烷基羧醯胺類。

較適當的式(I-h)之具體實例為其中 R^{11-A} 代表氫之鹵
基烷基羧醯胺類。

較適當的式(I-h)之具體實例為其中 R^4 與 R^{11-A} 各代表
20 氫之鹵基烷基羧醯胺類。

特別被強調者為其中 R^4 代表氫之式(I)的化合物(與同
樣的第 1 至 8 類的化合物)。

特別被強調者為其中 R^4 代表甲醯基之式(I)的化合物(與同樣的第 1 至 8 類的化合物)。

此外，特別被強調者為其中 R^4 代表 $-C(=O)C(=O)R^5$ 之式(I)的化合物(與同樣的第 1 至 8 類的化合物)，其中 R^5 的定義如前面被說明者。

飽和的或不飽和的烴基，例如烷基或烯基，也包括帶有雜原子者，例如，於烷氧基(alcoxy)中，各可為直鏈型或支鏈型之基。

可能地經取代的基團可以是帶有單個或多個取代基，其中帶有多個取代基者，取代基可以為相同或相異，於是，所稱之“二烷基胺基”也包含不對稱地經取代之胺基，例如，甲基乙基胺基。

經鹵基取代的基團，例如，鹵基烷基，為帶有單個或多個的鹵基者，帶有多個鹵基取代基時，鹵素原子可以是相同或相異，在此之鹵素代表氟，氯，溴與碘，特別是氟，氯與溴。

列於前面之一般的或較適宜的基及/或說明可任意在個別的範圍與較適宜的範圍組合，它們也適用於最終產物以及相關的開始的與中間的產物，尤其是第 1 至第 6 類下的化合物可將其一般的與較適宜的、特別適宜的等定義下的基組合應用，其間可能製得各種可能的組合。

Description of 本發明的 process for the synthesis of 己基甲醯苯胺 s of the formula (T> as well as the

製法(a)

10

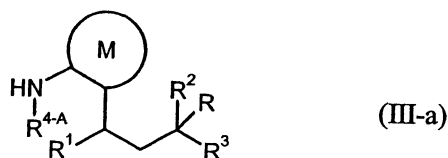


20

供進行本發明的製法(a)所需要作為另外的起始材料之苯胺衍生物類，其一般定義以式(III)代表，於式(III)中，較適宜的、特別適宜的或最特別適宜的 R ， R^1 ， R^2 ， R^3 ， R^4 與 M ，已被說明於相關的本發明之式(I)之較適宜的、特別適宜的或最特別適宜的 R ， R^1 ， R^2 ， R^3 ， R^4 與 M 。

- 44 -

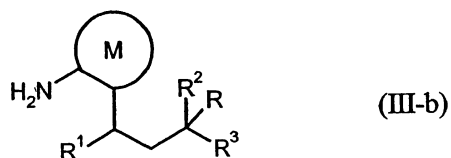
式(III-a)的苯胺衍生物



5

其中R, R¹, R², R³, R^{4-A}與M具有被說明如上的含義, 可得自:

c) 令式(III-b)之苯胺衍生物



10

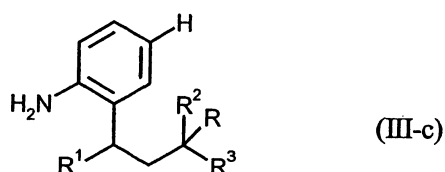
其中R, R¹, R², R³與M具有被說明如上的含義, 與式(IV)的鹵化物類反應



15

其中R^{4-A}與X²具有被說明如上的含義, 係在鹼存在下及稀釋介質存在下進行。

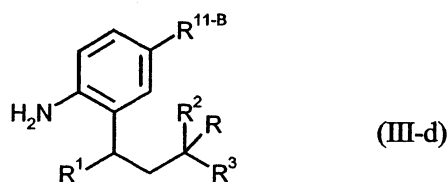
式(III-c)的苯胺衍生物



20

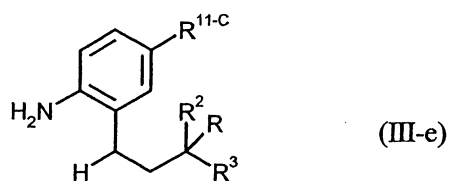
其中R, R¹, R²與R³具有被說明如上的含義, 可得自:

d) 令式(III-d)的苯胺衍生物類

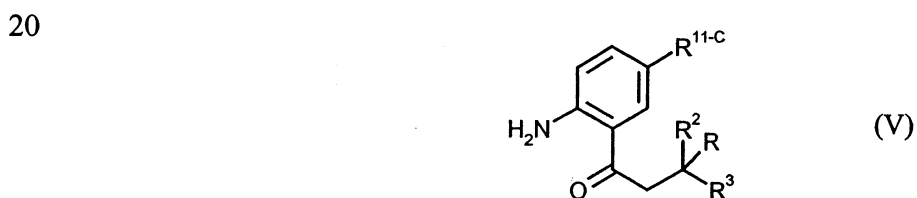


- 5 其中
 R^1 , R^2 與 R^3 具有被說明如上的含義,
 R^{11-B} 代表氟或氯,
 係在還原劑、催化劑及稀釋介質存在下進行。

10 式(III-e)的苯胺衍生物



- 15 其中
 R , R^2 與 R^3 具有被說明如上的含義且
 R^{11-C} 代表氟, 氯, 甲基, 異丙基, 甲硫基或三氟甲基,
 可得自:
 e) 令式(V)之鹵烷基酮基

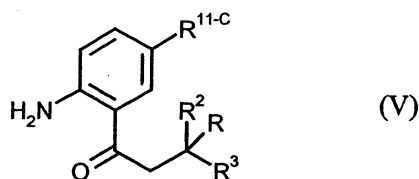


其中 R , R^2 , R^3 與 R^{11-C} 具有被說明如上的含義,

與聯胺或聯胺水合物在鹼(例如，鹼或鹼土金屬氫氧化物，例如氫氧化鈉或氫氧化鉀)存在下及可能地在稀釋介質存在下進行反應。

5

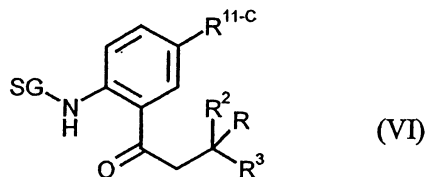
式(V)的鹵烷基酮基苯胺類



10

其中R，R²，R³與R^{11-C}具有被說明如上的含義，可得自：

f) 式(VI)之經保護的鹵烷基酮基苯胺類



15

其中

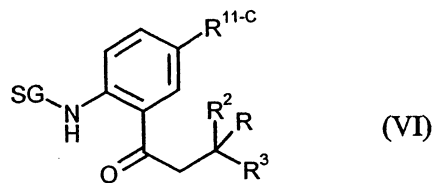
R，R²，R³與R^{11-C}具有被說明如上的含義且

SG 代表一種保護基，適宜地為Piv (第三-丁基羰基)，Boc (第三-丁氧基羰基)，Cbz(苯甲氧基羰基)，三氟乙醯基，Fmoc (9-芴基甲氧基羰基)或 Troc(2,2,2-三氯乙氧基羰基)，

20

在酸(例如鹽酸)存在下與可能地在稀釋介質存在下反應。

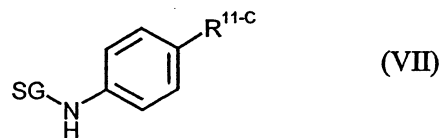
式(VI)之經保護的鹵烷基酮基苯胺類



5

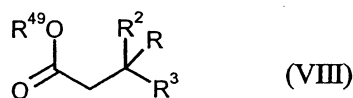
其中R, R², R³, R^{11-C}與SG具有被說明如上的含義, 可得自:

g) 式(VII)之經保護的苯胺類



10

其中, R^{11-C}與SG具有被說明如上的含義, 與式(VIII)的酯反應



15

其中

R, R²與R³具有被說明如上的含義,

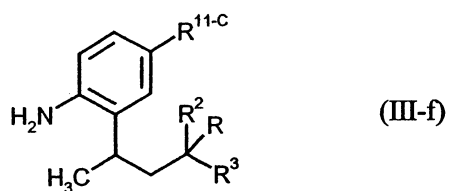
R⁴⁹ 代表C₁-C₄烷基, 適宜地為甲基或乙基,

20

係在稀釋介質與有機金屬鹼類存在下進行。

式(VII)的經保護的苯胺類與式(VIII)的酯類為已知的化合物。

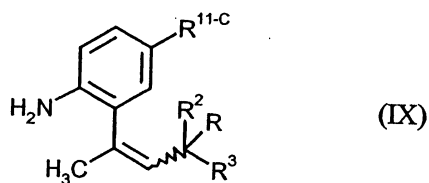
式(III-f)的苯胺衍生物



5 其中

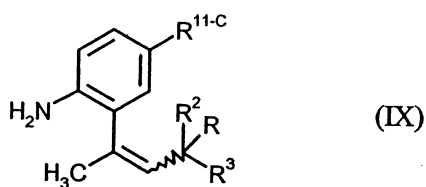
R , R^2 , R^3 與 R^{11-C} 具有被說明如上的含義，可得自氫化下述的化合物：

h) 式(IX)之烯烴類



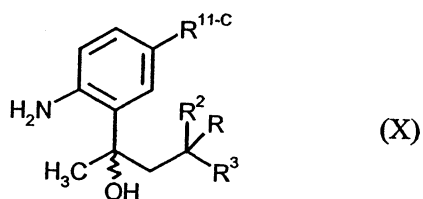
其中 R , R^2 , R^3 與 R^{11-C} 具有被說明如上的含義，可能地於稀釋介質存在下與可能地在催化劑存在下進行。

式(IX)的烯烴類



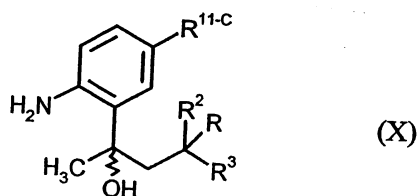
其中 R , R^2 , R^3 與 R^{11-C} 具有被說明如上的含義，可得自對下述化合物進行脫水反應

i) 式(X)之羥基烷基苯胺類



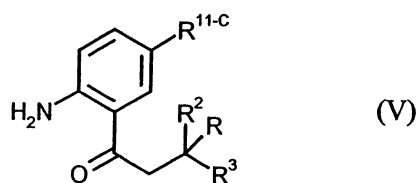
5 其中 R ， R^2 ， R^3 與 R^{11-C} 具有被說明如上的含義，可能地在稀釋介質存在下與在一種酸存在下進行。

式(X)之羥基烷基苯胺類



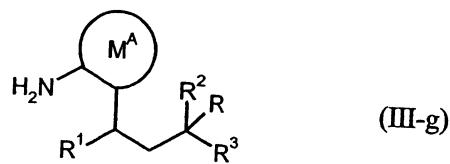
10 其中 R ， R^1 ， R^2 ， R^3 ， R^{4-A} 與 M 具有被說明如上的含義，可得自：

15 k) 令式(V)之鹵基烷基酮基苯胺類



20 其中 R ， R^2 ， R^3 與 R^{11-C} 具有被說明如上的含義，與有機金屬化合物(例如甲基鎂鹵化物)在稀釋介質存在下反應。

式(III-g)之苯胺衍生物類



其中

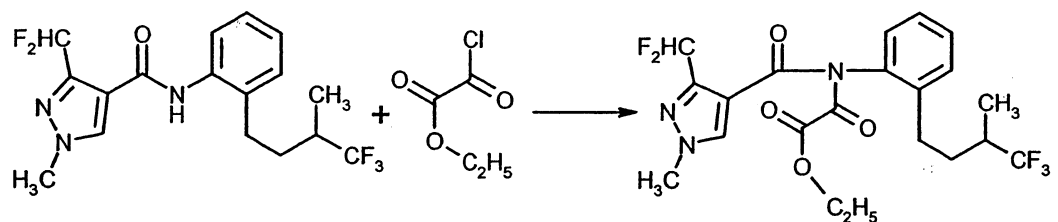
R^1 , R^2 與 R^3 具有被說明如上的含義且

M^A 在各種狀況下代表帶有單個 R^{11} 取代基之吡啶或嘧啶環或代表帶有單個 R^{11-A} 取代基之噻唑環，

可利用類似的方法製得或藉由已知的方法製得(參見EP-A 0 737 682)。

製法(b)

如果係使用3-(二氟甲基)-1-甲基-N-[2-(4,4,4-三氟-3-甲基丁基)苯基]-1H-吡唑-4-羧醯胺與乙基-氯(酮基)乙酸酯作為起始材料下，則本發明的製法(b)可被用下面的反應式說明：



供進行本發明的製法(b)所需要作為起始材料之己基甲醯苯胺類，其一般定義以式(I-a)代表，於式(I-a)中，較適宜的、特別適宜的或最特別適宜的 R , R^1 , R^2 , R^3 , M 與 A ，已被說明於相關的本發明之式(I)之較適宜的、特別

適宜的或最特別適宜的相關基。

式(I-a)的己基甲醯苯胺類同樣地屬於本發明的化合物且為本申請案中的目的物，它們可根據本發明的製法(a) ($R^1 = \text{氫}$)製得。

5 供進行本發明的製法(b)所需要作為起始材料之鹵化物類類，其一般定義以式(IV)代表，於式(IV)中，較適宜的、特別適宜的或最特別適宜的 R^{4-A} ，已被說明於相關的本發明之式(I-b)之較適宜的、特別適宜的或最特別適宜的相關基， X^2 適宜地代表氯或溴。

10 式(IV)的鹵化物類為已知的化合物。

反應條件

所有的惰性有機溶劑類可被考慮作為供進行本發明製法(a)時之稀釋介質使用，這適宜地包括脂肪族的、脂環族的或芳族的烴類，例如，石油醚，己烷，庚烷，環己烷，
15 甲基環己烷，苯，甲苯，二甲苯或十氫萘；鹵基化的烴類，例如，氯苯，二氯苯，二氯甲烷，氯仿，四氯甲烷，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，甲基第三-戊基醚，二噁烷，四氫呋喃，
20 1,2-二甲氧基乙烷，1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚或醯胺類，例如，N,N-二甲基甲醯胺，N,N-二甲基乙醯胺，N-甲基甲醯替苯胺，N-甲基吡咯酮或六甲基磷酸三醯胺。

本發明的製法(a)係有必要於適當的酸接受者的存在下進行，所有常用的無機的或有機的鹼類可供此目的使

用，這些包括，適當地鹼土金屬氫化物類或鹼金屬氫化物類，氫氧化物類，醯胺類，醇化物類，乙酸鹽類，碳酸鹽類或碳酸氫鹽類，例如，氫化鈉，醯胺化鈉，甲醇鈉，乙醇鈉，第三-丁基化鉀，氫氧化鈉，氫氧化鉀，氫氧化銨，
5 乙酸鈉，乙酸鉀，乙酸鈣，乙酸銨，碳酸鈉，碳酸鉀，碳酸氫鉀，碳酸氫鈉或碳酸銨，以及三級胺類，例如，三甲基胺，三乙基胺，三丁基胺，N,N-二甲基苯胺，N,N-二甲基苯甲基胺，吡啶，N-甲基六氫吡啶，N-甲基嗎啉，N,N-二甲基胺基吡啶，二氮雜雙環辛烷(DABCO)，二氮雜雙環
10 壬烯(DBN)或二氮雜雙環十一碳烯(DBU)。

本發明的製法(a)有必要係於適當的縮合劑存在下進行，被考慮的縮合劑為那些典型地被用於這類醯胺反應者，可舉之為例者為可形成酸氯化物之試劑，例如，光氣，三溴化磷，三氯化磷，五氯化磷，磷的氧醯氯化物式硫醯
15 氯化物；形成酸酐類的試劑，例如，氯甲酸乙基酯，氯甲酸甲基酯，氯甲酸異丙基酯，氯甲酸異丁基酯或甲烷磺醯基氯；碳二醯胺類，例如N,N'-二環己基碳二醯胺(DCC)或其他常見的縮合劑類，例如，五氧化二磷，聚磷酸，N,N'-羰基二咪唑，2-乙氧基-1-乙氧基羰基-1,2-二氮喹啉
20 (EEDQ)，三苯基磷/四氯甲烷或溴三吡咯啶磷六氟磷酸鹽。

本發明的製法(a)有必要時係於適當的催化劑存在下進行，作為實例者為4-二甲基胺基吡啶，1-羥基苯並三唑或二甲基甲醯胺。

進行本發明的製法(a)時，反應溫度可在很大的範圍間

變化，通常是在0°C至150°C間進行，更適當的溫度為在0°C至80°C間。

進行本發明的製法(a)以合成式(I)的化合物時，通常對每莫耳的式(II)的羧酸類，使用0.2至5莫耳，宜為0.5至2莫耳，之式(III)的苯胺衍生物進行反應。

進行本發明的製法(b)與(c)時，所有的惰性有機溶劑類可被考慮作為稀釋介質使用，適宜地包括脂肪族的、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；鹵基化的烴類，例如，氯苯，二氯苯，二氯甲烷，氯仿，四氯甲烷，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，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或醯胺類，例如，N,N-二甲基甲醯胺，N,N-二甲基乙醯胺，N-甲基甲醯替苯胺，N-甲基吡咯酮或六甲基磷酸三醯胺。

本發明的製法(b)與(c)係於一種鹼存在下進行，所有常見的無機的或有機的鹼類可供此目的使用，這些包括，較適宜地，鹼土金屬氫化物類或鹼金屬氫化物類、氫氧化物類、醯胺類、醇化物類、乙酸鹽類、碳酸鹽類或碳酸氫鹽類，例如，氫化鈉，醯胺化鈉，甲醇鈉，乙醇鈉，第三-丁酸鉀，氫氧化鈉，氫氧化鉀，氫氧化銨，乙酸鈉，乙酸鉀，乙酸鈣，乙酸銨，碳酸鈉，碳酸鉀，碳酸氫鉀，碳酸氫鈉或碳酸氫鉍，以及四級胺類，例如，三甲基胺，三乙基胺，二丁基胺，N,N-二甲基苯胺，N,N-二甲基 苯甲

基胺，吡啶，N-甲基六氫吡啶，N-甲基嗎啉，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)或二氮雜雙環十一碳烯(DBU)。

5 進行本發明的製法(b)與(c)時，反應溫度可在很大的範圍間變化，通常是在0°C至150°C間進行，更適當的溫度為在20°C至110°C間。

進行本發明的製法(b)以合成式(I)的化合物時，通常對每莫耳的式(I-a)的己基甲醯苯胺，使用0.2至5莫耳，宜為0.5至2莫耳，之式(IV)的鹵化物進行反應。

10 進行本發明的製法(c)以合成式(III-a)的化合物時，通常對每莫耳的式(III-b)的苯胺衍生物，使用0.2至5莫耳，宜為0.5至2莫耳，之式(IV)的鹵化物進行反應。

15 進行本發明的製法(d)時，所有的惰性有機溶劑類可被考慮作為稀釋介質使用，適宜地包括脂肪族的、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；醚類，例如，二乙基醚，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；醯胺類，例如，N,N-二甲基甲醯胺，N,N-二甲基乙醯胺，N-甲基甲醯替苯胺，N-甲基吡咯酮或六甲
20 基磷酸三醯胺；亞砷類，例如，二甲亞砷；砷類，例如，砷；醇類，例如，甲醇，乙醇，正-或異丙醇，正-、異-，第二-或第三-丁醇，乙二醇，丙-1,2-二醇，乙氧基乙醇，甲氧氧基乙醇，二乙二醇單甲基醚，二乙二醇單乙基醚，

三乙二醇，其與水之混合物或純水。

本發明的製法(d)係於金屬存在下進行，較佳者為過渡元素的金屬，例如，鈮，鉑，銻，鐵，鈷，鈦，鋇或鎳，有
5 必要時，此金屬可被束縛至一受質上，例如，碳，樹脂，沸石類，鹼金屬或鹼土金屬硫酸鹽類。

本發明的製法(d)係在還原劑存在下進行，適當的還原劑材料為元素氫，甲酸鹽類，較佳者為鹼金屬甲酸鹽類，
● 例如甲酸鈉，但也可使用甲酸銨或使用金屬氫化物類(加氫脫鹵化作用)。

10 本發明的製法(d)可在酸類存在下進行，較適宜的材料為有機酸類，例如，甲酸，乙酸，抗壞血酸，但也包括無機酸類，例如，氫氯酸或硫酸。

本發明的製法(d)可在鹼類存在下進行，較適宜的材料為有機鹼類，例如，吡啶，也包括鹼金屬或鹼土金屬之氫
15 氧化物類，例如，氫氧化鈉或氫氧化鋇。

● 進行本發明的製法(d)時，反應溫度可在很大的範圍間變化，通常是在-80°C至300°C間進行，更適當的溫度為在0°C至200°C間。

以元素氫進行反應時，本發明的製法(d)係於氫氣壓力
20 為介於0.5與200巴，較好為介於1與100巴間進行。

進行本發明的製法(e)以合成式(III-c)的化合物時，通常對每莫耳的式(III-d)的苯胺衍生物，使用0.8至1000莫耳，宜為1至500莫耳之還原劑(甲酸銨，氫化物，等等)以進行反應。

進行本發明的製法(e)時，所有的惰性有機溶劑類可被考慮作為稀釋介質使用，適宜地包括脂肪族的、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，四氯甲烷，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，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；酮類，例如，丙酮，丁酮，甲基異丁基酮或環己酮己酮；腈類，例如，乙腈，丙腈，正-或異-丁腈或苯甲腈；醯胺類，例如，N,N-二甲基甲醯胺，N,N-二甲基乙醯胺，N-甲基甲醯替苯胺，N-甲基吡咯酮或六甲基磷酸三醯胺；亞砷類，例如，二甲亞砷；砷類，例如，砷；醇類，例如，甲醇，乙醇，正-或異丙醇，正-、異-、第二-或第三-丁醇，乙二醇，丙-1,2-二醇，乙氧基乙醇，甲氧氧基乙醇，二乙二醇單甲基醚，二乙二醇單乙基醚，三乙二醇，其與水之混合物或純水。

進行本發明的製法(e)係在一種鹼存在下進行，較適宜的材料包括鹼土金屬或鹼金屬之氫氧化物類，例如，氫氧化鈉 氫氧化鉀，氫氧化銨。

進行本發明的製法(e)時，反應溫度可在很大的範圍間變化，通常是在100°C至300°C間進行，更適當的溫度為在150°C至250°C間。

進行本發明的製法(e)以合成式(III-e)的化合物時，通

常對每莫耳的式(V)的鹵烷基酮基苯胺，使用0.2至5莫耳，宜為0.5至3莫耳之聯胺或聯胺水合物進行反應。

進行本發明的製法(f)時，所有的惰性有機溶劑類可被考慮作為稀釋介質使用，適宜地包括脂肪族的、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，四氯甲烷，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，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；酮類，例如丙酮，丁酮，甲基異丁基酮或環己酮；腈類，例如，乙腈，丙腈，正-或異-丁腈或苯甲腈；醯胺類，例如，N,N-二甲基甲醯胺，N,N-二甲基乙醯胺，N-甲基甲醯替苯胺，N-甲基吡咯酮或六甲基磷酸三醯胺；亞砷類，例如，二甲亞砷；砷類，例如，砷；醇類，例如，甲醇，乙醇，正-或異丙醇，正-、異-、第二-或第三-丁醇，乙二醇，丙-1,2-二醇，乙氧基乙醇，甲氧氧基乙醇，二乙二醇單甲基醚，二乙二醇單乙基醚，三乙二醇，其與水之混合物或純水。

本發明的製法(f) 係於酸存在下進行，適宜被應用於此者包括無機酸類，例如，氫氯酸，氫頭酸或氫溴酸與硫酸，或也包括有機酸類，例如三氟乙酸與三氟甲磺酸。

進行本發明的製法(f)時，反應溫度可在很大的範圍間變化，通常是在0°C至300°C間進行，更適當的溫度為在20°C至200°C間。

進行本發明的製法(f)以合成式(V)的化合物時，通常對每莫耳的式(VI)的經保護的鹵烷基酮基苯胺，使用0.1至10000莫耳，宜為1至2000莫耳一種酸進行反應。

5 進行本發明的製法(g)時，所有的惰性有機溶劑類可被考慮作為稀釋介質使用，適宜地包括脂肪族的、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；醚類，例如，二乙基醚，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；

10 本發明的製法(g)係在一種有機金屬化合物存在下進行，較適合的材料包括有機鋰化合物類，例如，正-、第二-或第三-丁基鋰，苯基鋰或甲基鋰。

15 進行本發明的製法(g)時，反應溫度可在很大的範圍間變化，通常是在-120°C至100°C間進行，更適當的溫度為在-80°C至20°C間。

進行本發明的製法(g)以合成式(VI)的化合物類時，通常對每莫耳式(VII)的經保護的苯胺，使用0.2至5莫耳，適宜地為0.5至2莫耳的式(VIII)之酯。

20 進行本發明的製法(h)時，所有的惰性有機溶劑類可被考慮作為稀釋介質使用，適宜地包括脂肪族的、脂環族的或芳族的烴類，例如，石油醚，己烷，庚烷，環己烷，甲基環己烷或十氫萘；醚類，例如，二乙基醚，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，1,2-二甲氧基乙烷或1,2-二乙氧基乙烷；醇類，例如，
甲醇，乙醇，正-或異丙醇，正-、異-、第二-或第三-丁醇，
乙二醇，丙-1,2-二醇，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，其與水之混合物或純水。

5 本發明的製法(h)有必要時係於催化劑存在下進行，可
使用所有典型地被運用於進行氫化反應之催化劑，實例包
括：阮來鎳(Raney nickel)，鈀或鉑，可能地被置於受質上，
例如，活性碳。

10 本發明的製法(h)中之氫化反應也可以在三乙基矽烷
存在下，替代使用氫氣與催化劑下進行。

進行本發明的製法(h)時，反應溫度可在很大的範圍間
變化，通常是在0°C至150°C間進行，更適當的溫度為在
20°C至100°C間。

15 本發明的製法(h)是於氫氣壓力在介於0.5與200巴，較
適宜地在介於2與50巴，特別適宜地於介於3與10巴間的壓
力下進行。

20 進行本發明的製法(i)時，所有的惰性有機溶劑類可被
考慮作為稀釋介質使用，適宜地包括脂肪族的、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；鹵基化的烴類，
例如，氯苯，二氯苯，二氯甲烷，氯仿，四氯甲烷，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，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；酮類，

例如，丙酮，丁，甲基異丁基酮或環己酮；腈類，例如，乙腈，丙腈，正-或異-丁腈或苯甲腈；醯胺類，例如，N,N-二甲基甲醯胺，N,N-二甲基乙醯胺，N-甲基甲醯替苯胺，N-甲基吡咯酮或六甲基磷酸三醯胺；酯類，例如，乙酸甲酯或乙酸乙酯；亞砒類，例如，二甲亞砒；砒類，例如，砒；醇類，例如，甲醇，乙醇，正-或異丙醇，正-、異-、第二-或第三-丁醇，乙二醇，丙-1,2-二醇，乙氧基乙醇，甲氧氧基乙醇，二乙二醇單甲基醚，二乙二醇單乙基醚，其與水的混合物或純水。

本發明的製法(i) 係於酸存在下進行，可以使用所有的無機的與有機的質子性酸類與路易士酸類以及所有的聚合性酸類，這些包括，例如，氯化氫，硫酸，磷酸，甲酸，乙酸，三氟乙酸，甲磺酸，三氟甲磺酸，甲苯磺酸，三氟化硼（也可為醚化物型式），醇，三氯化鋁，四氯化鈦，四丁基-正鈦酸鹽，氯化鋅，氯化鐵(II)，五氯化錫，酸性離子交換劑類，酸性粘土與酸性矽膠。

進行本發明的製法(i)時，反應溫度可在很大的範圍間變化，通常是在0°C至150°C間進行，更適當的溫度為在0°C至80°C間。

本發明的製法(i)與(h)也可串聯(於單一的反應瓶中)進行反應，為此目的，式(X)的化合物可在三乙基矽烷存在下，可能地在稀釋介質(如製法(i)中之適當的溶劑類)存在下，可能地在酸(供製法(i)中使用之適當的酸類)存在下進行。

進行本發明的製法(k)時，所有的惰性有機溶劑類可被考慮作為稀釋介質使用，適宜地包括脂肪族的、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；醚類，例如，二乙基醚，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。

本發明的製法(k)係在一種有機金屬化合物存在下進行，較適合的材料包括甲基鎂氯化物、溴化物、或碘化物或甲基鋰。

進行本發明的製法(k)時，反應溫度可在很大的範圍間變化，通常是在-120°C至200°C間進行，更適當的溫度為在-80°C至100°C間。

進行本發明的製法(k)供合成式(X)的化合物類時，通常對每莫耳式(V)之鹵基烷基酮基苯胺，使用0.8至10莫耳，較適宜地為1至5莫耳的有機金屬化合物進行反應。

除非另有說明，根據本發明的所有製法通常是在大氣壓下進行，然而，其也可能在增、減壓下進行，通常為在介於0.1巴與10巴間反應。

根據本發明的材料具有強有力的制微生物的活性且可被用於對抗不想要的微生物類，例如，真菌與細菌，被應用於作物保護與材料保護方面。

殺真菌劑類可被應用於供控制下列真菌以保護作物：根腫菌綱(Plasmodiophoromycetes)、卵菌綱(Oomycetes)、

壺菌綱(Chytridiomycetes)、接合菌綱(zygomycetes)、子囊菌綱(Ascomycetes)、擔子菌綱(Basidiomycetes)與不完全菌綱(Deuteromycetes)。

殺細菌劑類可被應用於控制下列細菌以保護作物：假單胞菌科(Pseudomonadaceae)、根瘤菌科(Rhizobiaceae)、腸道桿菌科(Enterobacteriaceae)、棒狀桿菌科(Corynebacteriaceae)與鏈球菌科(Streptomycetaceae)。

一些造成真菌與細菌性疾病之一些病原菌，其學名被列於上述者可予舉例說明如下，但不限於它們而已：

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

假單胞菌(*Pseudomonas* species)，例如，*Pseudomonas syringae* pv. *Lachrymans*；

Erwinia species，例如蘋果熱萎凋菌(*Erwinia amylovora*)；

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

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

假霜霉菌(*Pseudoperonospora* species)，例如葎草假霜霉(*Pseudoperonospora humuli*)或瓜類露菌(*Pseudoperonospora cubensis*)；

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

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

霜霉 (*Peronospora species*)，例如豌豆霜霉 (*Peronospora pisi*)或莖薹霜霉 (*P. brassicae*)；

5 白粉菌 (*Erysiphe species*)，例如禾白粉菌；

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

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

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

核腔菌 (*Pyrenophora species*)，例如圓核腔菌病菌 (*Pyrenophora teres*)或禾草核腔病 (*P. graminea*) (分生孢子型: *Drechslera*, syn: 長蠕孢)；

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

● 單孢銹菌 (*Uromyces species*)，例如疣頂單孢銹菌 (*Uromyces appendiculatus*)；

20 銹菌 (*Puccinia species*)，例如小麥赤銹病菌 (*Puccinia recondita*)；

菌核菌屬 (*Sclerotinia species*)，例如白黴菌 (*Sclerotinia sclerotiorum*)；

腥黑粉菌屬 (*Tilletia species*)，例如小麥網腥黑粉菌

(*Tilletia caries*) ;

黑穗菌屬(*Ustilago species*)，例如 *Ustilago nuda* 或燕麥散黑粉菌(*Ustilago avenae*) ;

5 薄膜革菌屬(*Pellicularia species*)，例如佐佐木薄膜革菌(*Pellicularia sasakii*) ;

Pyricularia species，例如稻熱菌(*Pyricularia oryzae*) ;

● 鐮孢菌屬(*Fusarium species*)，例如大刀鐮孢(*Fusarium culmorum*) ;

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

殼針孢屬(*Septoria species*)，例如穎枯殼針孢菌(*Septoria nodorum*) ;

球腔菌屬(*Leptosphaeria species*)，例如 *Leptosphaeria nodorum* ;

15 尾孢菌屬(*Cercospora species*)，例如變灰尾孢(● *Cercospora canescens*) ;

鏈格孢菌屬(*Alternaria species*)，例如芸薹輪紋病菌(*Alternaria brassicae*) ;

20 *Pseudocercospora* 諸種，例如 *Pseudocercospora herpotrichoides* ,

立枯菌(*Rhizoctonia species*)，例如，立枯絲核菌(*Rhizoctonia solani*)。

本發明的活性物質類對於植物也顯現相當的強化防

禦作用，因此，它們適於供固定於植物內部作為植物本身的防禦以對抗不想要的微生物之攻擊。

於本說明書中，植物-強化防禦的(抗性-誘發的)物質是指那些物質其能刺激植物的免疫系統，使得受處理的植物被接著接種上不想要的微生物時，它們能表現實質的抗性以對抗這些微生物類。

本情況下，不想要的微生物是指可致病的真菌、細菌與病毒類，因此，本發明的物質可在處理對抗所提的病原菌後，被用以保護植物一段時間，保護的期間通常為植物經活性化合物處理後延續1至10天，宜為1至7天。

在需用來控制植物疾病的濃度下，植物對活性物質類顯現良好的耐性之事實下，使得活性物質能被用來處理地表上的植物部分、繁殖用的莖桿與種子、以及土壤。

就本方面，本發明的活性物質特別成功地被用於對抗穀物方面的疾病，例如，用於對抗銹菌(*puccinia species*)引起的疾病，以及用於對抗發生於葡萄、蔬果栽培方面的疾病，例如，由灰黴菌、黑星菌與鏈格孢菌引起者。

本發明的活性物質也適於增加作物的產量；此外，它們對植物顯示具較低的毒性與較好的耐受性。

有必要時，本發明的活性物質，在某一濃度與施用率下，也可作為除草劑、影響植物生長、以及供防治動物有害生物的物質使用，它們也可被作為中間物與起始物供合成其他的活性物質類。

所有的植物與植物部位可根據本發明予以處理，可了

解的，所稱之植物是指包括所有植物及植物總體，例如所要的野生植物與不想要的野生植物(雜草)或作物植物(包括天然發生的作物植物)，作物植物的栽種可得自傳統的育種與馴化方法或是藉由生物科技與基因技術或併用這些方法，包括轉殖基因植物與包括能或不能被植物育種者認證保護之植物栽培品種；植物的部位是指所有植物位於地表上的與位於地表下的部位與器官，例如筍、葉、花與根，可提及者例如，葉子、針葉、莖、樹桿、花、果實體、果實與種子，以及根、球根與匍匐莖，植物的部位也包括被收割的材料與生長著的與繁殖用的材料，例如插枝、塊莖、匍匐莖、幼芽與種子。

根據本發明以活性物質處理植物與植物的部分，其方式可以是藉由傳統的方法，直接地施加或作用其生活環境、生養空間或儲存場所，例如藉由浸泡、噴灑、蒸發、霧化、撒佈、分佈及，施加於繁殖用材料上，特別是種子，可對其加上一層或多層塗覆物。

於保護材料方面，本發明的材料可被用於保護工業材料以對抗不想要的微生物之侵擾與摧毀。

本說明文中所稱的工業材料是指被製備供工業使用的無生命的材料，例如，想以本發明的活性物質類保護免於微生物的改變或催毀者，例如，粘著劑類、漿糊類，紙與卡紙，織品，皮革，木料，塗料與塑膠物品，冷卻用潤滑劑類及其他的可被微生物感染或催毀的材料，製造工廠的零件，例如可能因微生物之增殖而損壞之冷卻-水循環系

統也涵蓋於本範圍中，本發明範圍中的工業材料，適宜地包含粘著劑類，漿糊類，紙與卡紙，皮革，木料，塗料，冷卻用的潤滑劑類與熱-交換液體，特別是木料。

會影響工業材料之降解或改變的微生物類包括，例如，細菌，真菌，酵母菌，藻類與粘液菌等，本發明的活性物質適宜於作用以對抗真菌(特別是黴菌類)、使木頭褪色及催毀木頭之真菌(擔子菌綱)以及對抗粘液菌類與藻類。

被列舉作為實例者有學名如下的微生物類：

交鏈孢菌屬(*Alternaria*)，例如 *Alternaria tenuis*，
麴菌屬(*Aspergillus*)，例如黑麴菌(*Aspergillus niger*)，
毛殼菌屬(*Chaetomium*)，例如球毛殼(*Chaetomium globosum*)，
粉孢革菌屬(*Coniophora*)，例如粉孢革菌(*Coniophora puetana*)，
香菇屬(*Lentinus*)，例如虎皮香菇(*Lentinus tigrinus*)，
青黴菌屬(*Penicillium*)，例如藍色青黴菌(*Penicillium glaucum*)，
多孔蕈菌屬(*Polyporus*)，例如變色多孔菌(*Polyporus versicolor*)，
Aureobasidium 菌屬，例如 *Aureobasidium pullulans*，
Sclerophoma 菌屬，例如 *Sclerophoma pityophila*，
Trichoderma 菌屬，例如 *Trichoderma viride*，
艾歇利希菌屬(*Escherichia*)，例如大腸桿(*Escherichia coli*)，

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

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

5

視其特別的物理及/或化學性質，活性物質可被配製於典型調配劑中，例如溶液類，乳液類，懸浮劑類，粉劑，泡沫劑，膏劑，粒劑，氣霧劑與置於聚合性物質內的微膠囊劑與供種子塗覆的組成物，以及超-低容量冷及溫霧調配劑類。

10

這些調配劑係以一般的方式製備，例如將活性物質混合展延劑，即，液體溶劑類，加壓下的液化氣體及/或固體載劑材料，有必要時，配合使用介面活性劑，即，乳化劑及/或分散劑及/或泡沫形成劑；如果使用的展延劑為水時，也可應用，例如，有機溶劑作為輔助溶劑類，下面為主要被考慮者：芳族類，例如二甲苯、甲苯或烷基苯；氯化的芳族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，例如環己烷或石蠟類，例如石油餾分；醇類，例如丁醇或甘醇以及其醚類與酯類；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，例如二甲基甲醯胺與二甲亞砷；以及水。液化的氣體展延劑類或載劑是指在標準的溫度與壓力下為氣體之液體，例如氣溶液噴射劑類，例如鹵化的烴類，或是丁烷，丙烷，氮氣與二氧化碳，可考慮使用的固體載劑

15

20

為，例如研細的天然礦物類粉末，例如高嶺土、粘土、滑石、白堊土、石英、美國活性白土、蒙脫土或矽藻土以及研細的合成礦物類，例如高度分散的二氧化矽，氧化鋁與矽酸鹽類；適於製備顆粒體之固態載劑為，例如，碾碎並分劃過的天然礦物類，例如，方解石、輕石、大理石、海泡石、白雲石，以及合成之有機與無機配料之顆粒，與有機材料顆粒，例如，鋸屑、椰子殼、玉米穗軸與菸草莖；適當的乳化劑類及/或泡沫-形成材料為，例如，非離子與陰離子的乳化劑類，例如聚氧乙烯脂肪酸酯類，聚氧乙烯脂肪族醇醚類，例如，烷基芳基聚甘醇醚類、烷基磺酸鹽類、烷基硫酸鹽類、芳基磺酸鹽類，以及蛋白質水解產物；適當的分散劑為，例如，木質素亞硫酸廢液與甲基纖維素。

配製劑中也可包含粘著劑類，例如，羧甲基纖維素，呈粉狀、粒狀或乳膠狀之天然與合成的聚合物，例如，阿拉伯膠、聚乙烯醇，聚乙烯醋酸酯，以及天然磷脂質類，如腦磷脂與卵磷脂，與合成的磷脂質類，其他的添加物可以是礦物油類與植物油類。

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，及有機染料，例如，茜素染料，偶氮類染料與金屬□花青染料與微量營養成分，例如鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬與鋅等的鹽類。

調配劑中通常包含介於0.1與95%重量計間的活性物質，宜為介於0.5與90%間者。

根據本發明的活性物質，可以其原態或在其調配劑中

與已知的殺真菌劑類，殺細菌劑類，殺蟎劑類，殺線蟲劑類或殺昆蟲劑類作成混合物被使用，是為了，例如，增廣活性譜或預防發展出抗藥性，於許多的情況下，可得到增效的效果，即，混合物的活性要大於各個個別組分的活性之和。

示範性配方組分類的實例包括如下：

殺真菌劑類：

2- 苯基苯酚；8- 羥基喹啉硫酸鹽；阿西苯唑拉 (acibenzolar)-S- 甲基；阿得摩福(aldimorph)；醯胺福美特 (amidoflumet)；安丙基松(ampropylfos)；安丙基松-鉀 (ampropylfos-potassium)；安多普明 (andoprim)；苯胺精 (anilazine)；氮雜克唑 (azaconazole)；阿唑昔唑丙 (azoxystrobin)；本達樂 (benalaxyl)；本達樂-M；本達尼 (benodanil)；免賴得 (benomyl)；本塞利克-異丙基 (benthiavalicarb-isopropyl)；本札馬克利 (benzamacril)；本札馬克基-異丁基 (benzamacril-isobutyl)；白拉那松 (bilanafos)；白那巴克 (binapacryl)；聯苯 (biphenyl)；比多農 (bitertanol)；保米黴素-S；溴克利 (bromuconazole)；布瑞莫 (bupirimate)；得滅多 (buthiobate)；丁基胺；聚硫化鈣；卡布辛黴素 (capsimycin)；四氯丹 (captafol)；蓋普丹 (captan)；貝芬替 (carbendazim)；卡保信 (carboxin)；卡普米 (carpropamide)；卡颯 (carvone)；清諾美硫特 (chinomethionat)；氯本塞宗 (chlobenthiazone)；氯芬唑

(chlorfenazole) ; 氯 尼 布 (chloroneb) ; 氯 塞 尼
(chlorothalonil) ; 氯 唑 林 特 (chlozolate) ; 克 吉 隆
(clozylacon) , 西 唑 發 米 (cyazofamid) ; 西 氟 芬 米
(cyflufenamid) ; 西 莫 辛 尼 (cymoxanil) ; 西 普 克 唑
5 (cyproconazole) ; 西 普 地 尼 (cyprodinil) ; 西 普 扶 喃
(cyprofuram) ; Dagger G ; 地 百 克 (debacarb) ; 二 氯 氟 尼
(dichlofluanid) ; 二 克 隆 (dichlone) ; 二 氯 芬 (dichlorophen) ;
二 環 美 (diclocymet) ; 得 克 滅 精 (diclomezine) ; 大 克 爛
(dicloran) ; 二 硫 芬 克 (diethofencarb) ; 待 芬 克 力
10 (difenoconazole) ; 待 富 美 多 寧 (diflumetorim) ; 得 滅 利 莫
(dimethirimol) ; 大 滅 芬 (dimethomorph) ; 大 滅 唑 丙
(dimoxystrobin) ; 得 尼 克 唑 (diniconazole) ; 得 尼 克 唑 -M ;
大 那 克 (dinocap) ; 二 苯 基 胺 ; 二 比 松 (dipyrrithione) ; 普 得
松 (ditalimfos) ; 二 硫 琨 (dithianon) ; 多 寧 (dodine) ; 得 唑 隆
15 (drazoxolon) ; 護 粒 松 (edifenphos) ; 環 氧 克 唑
(epoxiconazole) ; 依 塞 波 辛 (ethaboxam) , 依 瑞 莫
(ethirimol) ; 依 得 力 (etridiazole) ; 芬 莫 沙 動 (famoxadone) ;
芬 那 米 動 (fenamidone) ; 芬 那 普 尼 (fenapanil) ; 芬 瑞 莫
(fenarimol) ; 芬 布 克 唑 (fenbuconazole) ; 芬 富 南 (fenfuram) ;
20 芬 赫 米 (fenhexamid) ; 芬 尼 唑 盆 (fenitropan) ; 芬 諾 克 山 尼
(fenoxanil) ; 芬 畢 克 尼 (fempiclonil) ; 芬 普 比 汀
(fenpropidin) ; 芬 普 福 (fenpropimorph) ; 富 爾 邦 (ferbam) ;
伏 寄 南 (fluazinam) ; 伏 本 吉 明 (flubenzimine) ; 伏 地 噁 尼
(fludioxonil) ; 伏 美 多 法 耳 (flumetover) ; 富 莫 芬 (flumorph) ;

富羅邁(fluoromide)；伏沙唑丙(fluoxastrobin)；富快克唑
 (fluquinconazole)；伏嘧多(flurprimidol)；護矽唑
 (flusilazole)；福磺醯胺(flusulfamide)；福多寧(flutolanil)；
 福採扶(flutriafol)；富皮特(folpet)；福賽得-鋁(fosetyl-Al)；
 5 福賽得-鈉(fosetyl-sodium)；福利達唑(fuberidazole)；福達
 樂(furalaxyl)；福滅比(furametpyr)；福卡波尼(furcarbonil)；
 福滅克斯(furmecyclox)；克熱淨(guazatine)；六氯苯；菲
 克斯(hexaconazole)；殺紋寧(hymexazol)；依滅列
 (imazalil)；印本克唑(imibenconazole)；亞胺基八丁三乙酸
 10 鹽(iminoctadine triacetate)；亞胺基八丁阿伯昔
 (iminocadine albesilate)；埃多克(iodocarb)；埃培克唑
 (ipconazole)；丙基喜樂松(IBP)；依普同(iprodione)；依普
 伐克(iprovalicarb)；依魯馬黴素(irumamycin)；亞賜圃
 (isoprothiolane)；異戊二酮(isovaledione)；嘉賜黴素
 15 (kasugamycin)；克雷索辛-甲基(kresoxim-methyl)；鋅錳乃
 浦(mancozeb)；錳乃浦(maneb)；滅非林宗(meferimzone)；
 滅盤尼比(mepanipyrin)；滅普寧(mepronil)；滅達樂
 (metalaxyl)；滅達樂-M；滅克唑(metconazole)；滅速克
 (methasulfocab)；滅扶連(methfuroxam)；免得爛(metiram)；
 20 滅多明索丙(metominostrobin)；滅硫斯(metsulfovax)；邁地
 奧黴素(mildiomycin)；邁克別尼(myclobutanil)；邁克唑林
 (myclozolin)；那他黴素(natamycin)；尼克比芬(nicobifen)；
 硝基塞-異丙基(nitrothal-isopropyl)；諾維富門
 (noviflumuron)；尼瑞莫(nuarimol)；歐扶斯(ofurace)；歐沙

唑賓(orysatrobin)；歐殺斯(oxadixyl)；歐林酸(oxolinic acid)；歐波克唑(oxpoconazole)；嘉保信(oxycarboxin)；
 歐芬辛素(oxyfenthiin)；北克丁唑(paclobutrazole)；平福唑
 (pefurazoate)；平克唑(penconazole)；賓克隆(pencycuron)；
 5 磷二芬(phosdiphen)；飛塞得(phthalide)；皮克辛多丙
 (picoxystrobin)；派拉寧(piperalin)；保粒黴素(polyoxins)；
 聚俄克林(polyoxorim)；撲殺熱(probenazole)；撲拉克
 (prochloraz)；撲滅寧(procymidone)；普拔克(propamocarb)；
 普朋辛-鈉(propanosine-sodium)；普克利(propiconazole)；
 10 甲基鋅乃浦(propineb)；普快吉得(proquinazid)；普硫克唑
 (prothioconazole)；普克斯多丙(pyraclostrobin)；白粉松
 (pyrazophos)；必芬諾克(pyrifenox)；必滅寧(pyrimethanil)；
 百快隆(pyroquilon)；普克西伏(pyroxyfur)；比咯奈純
 (pyrrolenitrine)；快克唑(quinconazole)；快諾絲芬
 15 (quinoxifen)；快多淨(quintozene)；辛克唑(simeconazole)；
 司比羅克胺(spiroxamine)；硫；得克力(tebuconazole)；得
 克安(tecloftalam)；得那淨(tecnazene)；四環拉西
 (tetcyclacis)；四克唑(tetraconazole)；腐絕(thiabendazole)；
 硫安芬(thicyofen)；塞氟醯胺(thifluzamide)；甲基-多保淨
 20 (thiophanate-methyl)；得恩地(thiram)，太歐西米
 (tioxyimid)；甲基-脫克松(toclofos-methyl)；甲苯氟尼得
 (tolyfluanid)；三泰芬(triadimefon)；三泰隆(triadimenol)；
 三雜別提(triazbutil)；三唑地(triazoxide)；三環醯胺
 (tricyclamide)；三賽唑(tricyclazole)；三得芬(tridemorph)；

賽福西唑丙(trifloxystrobin)；賽福米唑(triflumizole)；賽福
 寧(triforine)；三地克唑(triticonazole)；優尼克唑
 (uniconazole)；維利黴素A(validamycin A)；文克唑寧
 (vinclozolin)；鋅乃浦(zineb)；鋅來(ziram)；唑查醯胺
 5 (zoxamide)；(2S)-N-[2-[4-[[3-(4-氯苯基)-2-丙炔基]氧]-3-
 甲氧基苯基]乙基]-3-甲基-2-[(甲基磺醯基)胺基]丁烷醯
 胺；1-(1-萘基)-1H-吡咯-2,5-二酮；2,3,5,6-四氯-4-(甲基磺
 醯基)吡啶；2-胺基-4-甲基-N-苯基-5-噻唑羧醯胺；2-氯
 -N-(2,3-二氫-1,1,3-三甲基-1H-茛-4-基)-3-吡啶羧醯胺；
 10 3,4,5-三氯-2,6-吡啶二甲腈；actinovate；順式-1-(4-氯苯
 基)-2-(1H-1,2,4-三唑-1-基)環庚醇；1-(2,3-二氫-2,2-二甲基
 -1H-茛-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸甲酯；碳酸一鉀；N-(6-甲氧
 基-3-吡啶基)-環丙烷羧醯胺；N-丁基-8-(1,1-二甲基乙
 基)-1-氧雜螺[4.5]癸-3-胺；四硫碳酸鈉；與銅鹽類與調配
 15 製劑，例如酸性棗紅混合物(Bordeaux mixture)；氫氧化
 銅；萘酸銅；鹼性氯氧化銅；硫酸銅；銅合浦(cufraneb)；
 氧化銅；錳銅(mancopper)；快得寧-銅(oxine-copper)。

殺菌劑類：

20 波諾坡(bronopol)，二氯芬(dichlorphen)，奈比寧
 (nitrapyrin)，二硫胺基甲酸二甲酯鎳，嘉賜黴素，八希力
 酮(octhilinone)，呋喃羧酸(furancarboxylic acid)，氧四環
 黴素，普苯唑(probenazole)，鏈黴素，帖克他連
 (tecloftalam)，硫酸銅及其他銅製劑。

殺蟲劑/殺蟎劑/殺線蟲劑類：

1. 乙醯基膽鹼酯酶(AChE)抑制劑類

1.1 胺基甲酸酯類(例如，亞蘭克(alanycarb)，得滅克
 5 (aldicarb)，亞多西克(aldoxycarb)，亞西克(allyxycarb)，胺
 基卡布(aminocarb)，氮雜滅松(azamethiphos)，免敵克
 (bendiocarb)，免扶克(benfuracarb)，布芬克(bufencarb)，
 布他克(butacarb)，布嘉信(butocarboxim)，丁氧基羰基
 (butoxycarbonyl)，加保力(carbaryl)，加保扶(carbofuran)，
 10 丁基加保扶(carbosulfan)，氯索克(chloethocarb)，庫馬松
 (coumaphos)，氰芬松(cyanofenphos)，氰松(cyanophos)，
 二滅連(dimetilan)，愛殺芬克(ethiofencarb)，芬布克
 (fenobucarb)，芬硫克(fenothiocarb)，否美他奈
 (formetanate)，福硫克(furathiocarb)，異普克(isoprocab)，
 15 金屬-鈉(metals-sodium)，滅賜克(methiocarb)，納乃得
 (methomyl)，治滅蝨(metolcarb)，歐殺滅(oxamyl)，比里米
 克(pirimicarb)，普滅克(promecarb)，安丹(propoxur)，硫敵
 克(thiodicarb)，賽芬殺(thiofanox)，三雜美特(triazamate)，
 三滅沙克(trimethacarb)，XMC與xylylcarb)

20 1.2 有機磷酸酯類(例如，歐殺松(acephate)，氮雜滅松
 (azamethiphos)，谷速松(azinphos)(-甲基，-乙基)，布莫松
 -乙基(bromophos-ethyl)，溴芬文松(bromfenvinfos-甲基)，
 布他硫松(butathiofos)，卡丟松(cadusafos)，加芬松
 (carbophenothion)，氯乙氧松(chlorethoxyfos)，氯芬文松

(chlorfenvinphos) , 氯滅松 (chlormephos) , 陶斯松 (chlorpyrifos) (-甲基, -乙基) , 庫馬松 (coumaphos) , 氰芬松 (cyanofenphos) , 氰松 (cyanophos) , 氯芬文松 (chlorfenvinphos) , 滅多松 (demeton)-S-甲基 , 滅多松 (demeton)-S-甲基硫松 , 得拉松 (dialifos) , 大利松 (diazinon) , 二氯芬松 (dichlofenthion) , 二氯松 (dichlorvos)/DDVP , 二克多松 (dicrotophos) , 大滅松 (dimethoate) , 二甲基文松 (dimethylvinphos) , 二噁苯松 (dioxabenzofos) , 二硫松 (disulfoton) , EPN , 愛殺松 (ethion) , 依索普松 (ethoprophos) , 依特滅松 (etrimphos) , 飛福 (famphur) , 芬滅松 (fenamiphos) , 芬速福松 (fensulfothion) , 芬殺松 (fenthion) , 福比唑松 (flupyrzofos) , 大福松 (fonofos) , 福莫松 (formothion) , 福美塞連 (fosmethilan) , 福賽熱 (fosthiazate) , 飛達松 (heptenophos) , 碘芬松 (iodofenphos) , 艾普本松 (iprobenfos) , 愛唑松 (isazofos) , 亞芬松 (isofenphos) , 異丙基O-水楊酸酯 , 加福松 (isoxathion) , 馬拉松 (malathion) , 滅加松 (mecarbam) , 滅克里松 (methacrifos) , 達馬松 (methamidophos) , 滅大松 (methidathion) , 美文松 (mevinphos) , 亞素靈 (monocrotophos) , 乃立松 (naled) , 歐滅松 (omethoate) , 氧滅多松-甲基 (oxydemeton-methyl) , 巴拉松 (parathion) (-甲基, -乙基) , 賽達松 (phenthoate) , 福瑞松 (phorate) , 裕必松 (phosalone) , 益滅松 (phosmet) , 福賜米松 (phosphamidon) , 磷克 (phosphocarb) , 巴賽松

(phoxim)，亞特松(pirimiphos)(-甲基，-乙基)，佈飛松(profenofos)，普巴松(propaphos)，普佩他松(propetamphos)，普硫松(prothiofos)，普梭特(prothoate)，白克松(pyraclofos)，必達芬松(pyridaphenthion)，必達松(pyridathion)，拜裕松(quinalphos)，喜巴松(sebufos)，薩扶貼(sulfotep)，薩普松(sulprofos)，鐵畢密松(tebupirimifos)，得滅松(temephos)，托福松(terbufos)，四氯文松(tetrachlorvinphos)，硫美冬(thiometon)，三唑松(triazophos)，三克虱(triclorfon)，發米多松(vamidothion))

2. 鈉通道調節物類/依賴電壓的鈉通道阻斷劑類

2.1 擬除蟲菊酯類(Pyrethroides) (例如，克力寧(acrinathrin)，阿連寧(allethrin, d-順式-反式，d-反式)，乙型-賽扶寧(beta-cyfluthrin)，畢芬寧(bifenthrin)，生物-阿連寧，生物阿連寧-S-環戊基異構物，百山諾美寧(bioethanomethrin)，百普美寧(biopermethrin)，百雷滅寧(bioresmethrin)，氯伐波寧(chlovaporthrin)，順式-西普美寧(cis-cypermethrin)，順式-雷滅寧(cis-resmethrin)，順式-普美寧(cis-permethrin)，環西寧(clocythrins)，環普寧(cycloprothrin)，賽扶寧(cyfluthrin)，賽洛寧(cyhalothrin)，賽滅寧(cypermethrin)(alpha-，beta-，theta-，zeta-)，西芬諾寧(cyphenothrin)，DDT，delt-美寧(deltamethrin)，安本寧(empenthrin, IR-異構物)，愛芬化利(esfenvalerate)，依多芬普(etofenprox)，芬富寧(fenfluthrin)，芬普寧(fenpropathrin)，芬比寧(fenpyrithrin)，芬化利

(fenvalerate)，福布賽寧特(flubrocycythrinate)，護賽寧(flucythrinate)，氟芬普(flufenprox)，福美寧(flumethrin)，福化利(fluvalinate)，福芬普(fubfenprox)，gamma-賽洛寧，伊米普寧(imiprothrin)，卡得寧(kadethrin)，lambda-賽洛寧，美多福寧(metofluthrin)，普美寧(permethrin, 順式-，反式-)，芬諾寧(phenothrin, 1R-反式異構物)，普拉寧(prallethrin)，普福寧(profluthrin)，普垂芬布(protrifenbute)，必滅寧(pyresmethrin)，雷美寧(resmethrin)，RU 15525，西拉扶芬(silafluofen)，套-福化利(tau-fluvalinate)，得福寧(tefluthrin)，四連寧(terallethrin)，四美寧(tetramethrin, 1R-異構物)，泰滅寧(tralomethrin)，反式福寧(transfluthrin)，ZXI 8901，除蟲菊精(pyrethrins) (pyrethrum))

2.2 氧雜二并類(Oxadiazines) (例如，引多查克(indoxacarb))

3. 乙醯基膽鹼受體興奮劑類/拮抗劑類

3.1 氯尼古丁基類(chloronicotinylenes)/新類尼古丁類(neonicotinoides) (例如，亞滅培(acetamiprid)，克塞尼丁(clothianidin)，二諾帖夫(dinotefuran)，益達安(imidacloprid)，奈登比南(nitenpyram)，奈塞井(nithiazine)，塞克比(thiacloprid)，賽速安(thiamethoxam))

3.2 尼古丁(Nicotine)，免速達(bensultap)，培丹(cartap)

4. 乙醯基膽鹼(Acetylcholine)受體調節劑類

4.1 史賓諾賽類(Spinosyns) (例如，賜諾殺(spinosad))

5. GABA-控制的氯通道拮抗劑類

5.1 環二烯有機氯類(Cyclodiene organochlorines) (例如，坎芬克 (camphechlor)，氯丹 (chlordane)，安多沙凡 (endosulfan)，gamma-HCH，HCH，七氯 (heptachlor)，靈丹 (lindane)，甲氧基氯 (methoxychlor)

5.2 懷普類 (Fiproles) (例如，亞多普 (acetoprole)，伊塞普 (ethiprole)，懷普尼 (fipronil)，凡尼利普 (vaniliprole))

6. 氯通道活化劑類 (Chloride channel activators)

6.1 美克汀類 (Mectines) (例如，阿巴汀 (abamectin)，阿佛美汀 (avermectin)，因滅汀 (emamectin)，因滅汀苯甲酸鹽 (emamectin benzoate)，艾佛美汀 (ivermectin)，密滅汀 (milbemectin)，密黴素 (milbemycin))

7. 幼稚荷爾蒙擬似劑類 (Juvenile hormone mimetics) (例如，二歐芬諾蘭 (diofenolan)，伊波芬蘭 (epofenonane)，芬諾克 (fenoxycarb)，氫平 (hydroprene)，金諾平 (kinoprene)，美索平 (methoprene)，百利普芬 (pyriproxifen)，賽平 (triprene))

8. 蛻變激素 (Ecdysone) 興奮劑類/分裂劑類 (disruptors)

8.1 二醯基聯胺類 (Diacylhydrazine) (例如，克馬芬諾採 (chromafenozide)，鹵芬諾採 (halofenozide)，甲氧基芬諾採 (methoxyfenozide)，特布芬諾採 (tebufenozide))

9. 幾丁 (Chitin) 生合成抑制劑類

9.1 苯甲醯基尿素類 (例如，雙三氟隆 (bistrifluron)，克福隆 (chlofluzuron)，二福隆 (diflubenzuron)，福雜隆

(fluazuron) , 福環隆 (flucycloxuron) , 氟芬隆 (flufenoxuron) , 六伏隆 (hexaflumuron) , 祿芬隆 (lufenuron) , 諾瓦隆 (novaluron) , 諾維福隆 (noviflumuron) , 本福隆 (penfluron) , 得福隆 (teflubenzuron) , 賽福隆 (triflumuron))

9.2 布芬淨 (Buprofezin)

9.3 賽滅淨 (Cyromazine)

10. 氧化性磷酸化作用抑制劑類, ATP阻斷劑類 (disrupters)

10.1 汰芬隆 (Diafenthiuron)

10.2 有機錫類 (Organotins) (例如, 亞環錫 (azocyclotin) , 錫滿丹 (cyhexatin) , 芬佈賜 (fenbutatin oxide))

11. 藉打斷H-質子梯度進行氧化磷酸化的去偶合作用

11.1 吡咯類 (Pyrroles) (例如, 克凡派 (chlorfenapyr))

11.2 二硝基苯酚類 (例如, 百那培克 (binapacryl) , 丁諾布冬 (dinobuton) , 丁諾卡普 (dinocap) , DNOC)

12. 位置I電子傳輸抑制劑類 (electron transport inhibitors)

12.1 METI's (例如, 芬殺蟎 (fenazaquin) , 芬普蟎 (fenpyroximate) , 畢汰芬 (pyrimidifen) , 畢達本 (pyridaben) , 鐵芬比拉 (tebufenpyrad) , 多芬比拉 (tolfenpyrad))

12.2 Hydramethylnone

12.3 大克蟎 (Dicofol)

13. 位置II電子傳輸抑制劑類

13.1 Rotenones

14. 位置III電子傳輸抑制劑類

14.1 Acequinocyl, fluacrypyrim

15. 微生物的昆蟲腸道薄膜崩解劑 (Microbial insect intestinal membrane disrupters)

蘇力菌品系 (*Bacillus thuringiensis* strains)

5 16. 脂肪合成抑制劑類 (*Fat synthesis inhibitors*)

16.1 季酮酸類 (Tetronic acids) (例如, 螺二克芬 (spirodiclofen), 螺美西芬 (spiromesifen))

● 16.2 四元酸類 (Tetramic acids) (例如, 3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-酮基-1-氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙基碳酸酯 (別名: 碳酸, 3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-酮基-1-氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙基酯, CAS-Reg.-No.: 382608-10-8) 及碳酸, 順式-3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-酮基-1-氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙基酯 (CAS-Reg.-No.: 203313-25-1))

10 17. 羧醯胺類 (Carboxiamides)

15 (例如, 氟尼卡米 (flonicamid))

● 18. 促章魚胺的拮抗劑類 (Octopaminergic agonists) (例如, 三亞蟎 (amitraz))

19. 鎂-刺激的 ATPase 之抑制劑類 (例如, 歐蟎多 (propargite))

20 20. 苯甲二酸醯胺類 (Phthalamides) (例如, N²-1,1-二甲基-2-(甲基磺醯基)乙基)-3-碘-N¹-[2-甲基-4-[1,2,2,2-四氟-1-(三氟甲基)乙基]苯基]-1,2-苯二羧醯胺 (CAS-Reg.-No.: 272451-65-7))

21. Nereistoxin 類似物

(例如，硫賜安草酸氫鹽(Thiocyclam hydrogen oxalate)，硫速他普-鈉(thiosultap-sodium))

22. 生物有機體類(Bioorganisms)，荷爾蒙類或費洛蒙類(pheromones)

5 (例如，氮雜地雷克丁(azadirachtin)，桿菌屬(Bacillus spec.)，Beauveria spec.，codlemone，Metarrhizium spec.，Paecilomyces spec.，蘇力精(Thuringiensin)，Verticillium spec.)

23. 作用機制不明或非專一性之活性化合物類

10 23.1 氣體處理媒質(例如，鋁磷化物，甲基溴，硫氟化物)

23.2 選擇性拒食素(antifeedants) (例如，氟鋁化鈉(cryolite)，flonicamid，派滅淨(pymetrozine))

23.3 蟎生長抑制劑類(例如，克芬淨(clofentezine)，依殺蟎(etoxazole)，合賽多(hexythiazox))

15 23.4 醯胺福美特(amidoflumet)，本克塞(benclothiaz)，西脫(benzoximate)，貝路寧(bifenazate)，溴丙基樂(bromopropylate)，布芬淨(buprofezin)，蟎離丹(chinomethionat)，氯二美虱(chlordimeform)，氯苯吉(chlorobenzilate)，氯比克林(chloropicrin)，克塞唑苯(clothiazoben)，環普平(cycloprene)，西氟美多分

20 (cyflumetofen)，二環尼(dicyclanil)，芬雜肯(fenoxacrim)，fentrifanil，福本吉明(flubenzimine)，氟芬林(flufenerim)，福特淨(flutenzin)，gossyplure，海甲基隆(hydramethylnone)，金龜子性誘劑(japonilure)，美索達宗

(metoxadiazone)，石油醚(petroleum)，胡椒酮基丁氧化物(piperonyl butoxide)，油酸鉀，必達基(pyridalyl)，速服拉米得(sulfluramid)，四地松(tetradifon)，四速(tetrasul)，三拉忍(triarathene)，維布汀(verbutin)。

5 也包括以下化合物：化合物3-甲基苯基丙基胺基甲酸酯(tsumacide Z)，化合物3-(5-氯-3-吡啶基)-8-(2,2,2-三氟乙基)-8-氮雜雙環[3.2.1]-辛烷-3-甲腈(CAS-Reg. No. 185982-80-3)與相關的3-內-異構物(CAS-Reg. No. 185984-60-5) (參考 WO-96/37494，WO-98/25923)，與包
10 含具殺菌活性的植物萃出物、線蟲、真菌或病毒之製劑。

也可能為與其他已知的活性化合物類(例如除草劑類)，或與肥料與生長素、保護劑(safeners)或化學物質傳訊劑類(semiochemicals)所成之混合物。

此外，本發明的式(I)化合物也具有極佳的抗黴菌的活
15 性，它們具有極廣的抗黴菌活性譜，特別是對抗皮癬菌(dermatophytes)與酵母菌類，黴菌與二相的真菌[例如對抗念珠球菌諸種(candida species)，例如白色念珠球菌(*Candida albicans*)、*Candida glabrata*]，與表皮癬菌(*Epidermophyton floccosum*)，麴菌種，例如黑麴菌與
20 *Aspergillus fumigatus*，髮癬菌種，例如 *Trichophyton mentagrophytes*，小芽孢癬菌屬(*Microsporon species*)，例如犬小芽孢癬菌(*Microsporon canis*)與奧杜盎氏小芽孢癬菌(*Microsporon Audouini*)，所列舉的真菌僅是為了說明起見，不代表僅包含這些黴菌類。

此活性化合物可呈其調配劑或經由其調配好的使用型式被使用，例如即用型式之溶液類，懸浮劑類，噴灑粉末，膏劑，可溶的粉末，撒佈劑與粒劑，以習用方式施用，例如灌水，噴灑，霧化，撒佈，塵染，泡沫，分佈等，另可藉由超低容量法(ultra-low-volume)施用，或注入活性化合物本身進入土壤中的方式施用，也可被使用於處理植物的種子。

當使用本發明的活性化合物作為殺真菌劑時，施用的比率可根據施用方法在很大的範圍間變動；處理植物的部位時，活性化合物的施用率通常為介於0.1與10,000克/公頃間，宜為介於10與1000克/公頃間；供處理種子時，活性化合物的施用率通常為對每公斤的種子使用介於0.001克與50克，宜為對每公斤的種子施用介於0.01與10克間的量，處理土壤時，活性化合物的施用率通常為介於0.1與10,000克/公頃間，宜為介於1與5000克/公頃間。

如前面已提過的，根據本發明有可能處理所有的植物與其各部位，於一較佳的具體實例中，用於處理野生植物與植物栽培品種，或那些由傳統的生物育種得者，例如經雜交或原生質融合產生者，或處理其各部分，在另一較佳的具體實例中，係處理經適當地併用傳統的方法，藉由基因工程取得的轉殖基因植物與栽培品種與其各部位；“部位”或“植物的部位”或“植物部分”之含義如之前所解釋者。

特別適宜地，係處理市場可購得或使用中的植物或個別的植物栽培品種，所謂的植物栽培品種是指具有新穎性

質(“特色”)之品系，可以是經由傳統的育種、藉突變或藉重組DNA技術栽培而得者，這些可以是栽培品種(varieties)，品系(strains)、同型小種(biotype)或基因型品種(genotypes)。

5 視植物的種類或植物栽培品種，其分佈與生長條件(土壤，氣候，營養期間，特別養分)，依本發明的處理法也可獲得超加成的(“加乘的”)效果，故，例如減低的施用比率及/或增廣的活性譜及/或增進本發明使用的物質與組成物之活性、較佳的植物生長、對高溫或低溫更具耐力，更耐
10 乾旱或耐潮濕或耐土壤鹽含量、增加開花期、較容易收割、加速的成熟、較高的收穫量、較佳的品質及/或具較高的營養價值之收穫物、較佳的儲存安定性及/或收穫產品的可加工性，可能超出被預期的效果。

15 宜以本發明處理之轉殖基因的植物或植物品種(那些藉由基因工程取得者)包括所有經基因改造、獲得參與有利的有用性質(新特色)之基因材料之植物，這類被增進的特色之實例為：較佳的植物生長、更耐高溫或低溫，更耐乾旱或耐潮濕或耐土壤鹽含量、增加的開花期、更容易的收割、加速的成熟、較高的收穫量、較佳的品質及/或收穫品
20 具較高的營養價值、較佳的儲存特性及/或收穫產品的可加工性，其他尤其被強調的這類特色為：植物對抗動物及微生物等有害生物(例如昆蟲，蟎類，植物病源性真菌，細菌及/或病毒類)具更佳的防禦性，也增加植物對某些具除草活性的化合物之耐性，可提及的轉殖基因的植物為重要的

作物植物，例如穀物(例如小麥，稻米)，玉米，大豆，馬鈴薯，棉花，煙草與油菜以及果樹(蘋果樹，水梨，柑橘與葡萄)，其中特別要被強調的為玉米，大豆，馬鈴薯，棉花，煙草與油菜；特別被強調的特色為藉由形成於植物中的毒素使增加植物抵抗力以對抗昆蟲類、結繭的(cocooning)有害生物類、線蟲類與蛭蟪類，特別是那些藉由來自於蘇力菌桿菌形成於植物體中的基因材料(例如基因CryIA(a)，CryIA(b)，CryIA(c)，CryIIA，CryIIIA，CryIIIB2，Cry9c，Cry2Ab，Cry3Bb與CryIF以及其複方)(下面以”Bt植物”稱呼之)；也特別被強調的特色為藉由全株性後天抵抗性(SAR)，systemin，植物抗毒素(phytoalexins)，誘出物(elicitors)與抗性基因與相關的表現的蛋白質與毒素而增加植物對抗真菌、細菌與病毒之抗性；另一被強調的特色為植物對某些除草活性化合物(例如咪唑啉酮類，磺醯基脲類，草甘膦類或膦基三辛(phosphinotricin)(例如”PAT”基因)之耐性增加，參與至所要的特色的基因毫無疑問的也可與他種基因成混合型式出現於轉殖基因的植物，可提及的”Bt植物”為以下列貿易名稱(trade name)販售之玉米品種(maize varieties)、棉花品種、大豆品種與馬鈴薯品種：YIELD GARD®(例如玉米，棉花，大豆)，KnockOut®(例如玉米)，StarLink®(例如玉米)，Bollgard®(棉花)，Nucoton®(棉花)與NewLeaf®(馬鈴薯)；可提及的耐殺草劑的植物類為以下列貿易名稱販售之玉米品種、棉花品種與大豆品種：Roundup Ready®(耐嘉磷塞，例如玉米，棉花，

大豆), Liberty Link®(耐膦基三辛, 例如油菜), IMI®(耐咪唑啉酮)與STS®(耐磺醯基脲, 例如玉米);可提及的耐除草劑之植物(以傳統方式育成的耐除草劑之植物)包括以 Clearfielf®之名稱販賣者(例如玉米), 當然, 這些聲明也適用於具這些基因特色或具有仍在被發展的基因特色之植物栽培品種, 其在將來會被發展及/或販售者。

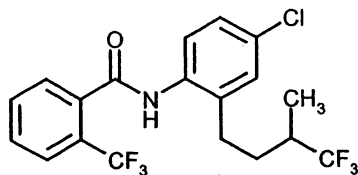
所列出之植物可依本發明的特別有利的方式以本發明的一般結構(I)之化合物或活性組成分混合物處理, 上述較佳的活性物質或混合物的範圍也適於處理這些植物的處理, 特別是以本文中特別提出的化合物或混合物給予之處理。

根據本發明的活性物質的合成與用途, 可由下述實例看出。

【實施方式】

合成實例

實例1

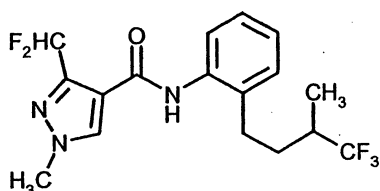


將溶解於2毫升四氫呋喃的302.0毫克(1.2毫莫耳)之4-氯-2-(4,4,4-三氟乙基-3-甲基-丁基)-苯基胺溶液, 加至溶解於10毫升四氫呋喃之275.3毫克(1.3毫莫耳)之2-三氟甲基

苯甲醯基氯與0.22毫升(1.6毫莫耳)三乙基胺中，在60℃下攪拌90分鐘，經矽膠過濾，並在真空下被濃縮。

可以製得505毫克的N-[4-氯-2-(4,4,4-三氟-3-甲基丁基)-苯基]-2-三氟甲基苯甲醯胺(99% 理論的收量) [$\log P$ (pH 2.3) = 4.08]。

實例2

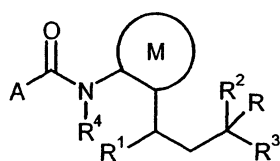


將0.14毫升(1.7毫莫耳)草酸二氯化物與4滴的二甲基甲醯胺加至懸浮於9毫升二氯甲烷之264.2毫克(1.5毫莫耳)的3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸懸浮液中在室溫下將反應混合物攪拌2小時，再混合入溶解於9毫升二氯甲烷中之325.9毫克(1.5毫莫耳)的2-(4,4,4-三氟-3-甲基丁基)-苯基胺與0.29毫升(2.1毫莫耳)的三乙基胺溶液，在室溫下攪拌16小時，添加7毫升的2N鹽酸，在室溫下攪拌10分鐘，然後分出有機層，經硫酸鎂乾燥，過濾並在真空下被濃縮。

可以製得525.0毫克的3-二氟甲基-1-甲基-1H-吡唑-4-羧酸，2-(4,4,4-三氟-3-甲基丁基)-苯基]-醯胺(89% 理論的收量) [$\log P$ (pH 2.3) = 2.93]。

列於下面表1中之式(I)的化合物，係依照類似於實例1與2，以及根據本發明(a)至(h)的合成方法之一般說明而製備得者。

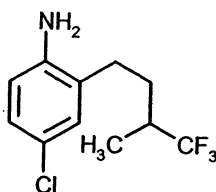
表 1



(I)

編號	R	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	M	A	logP
3	H	CH ₃	C ₂ H ₅	Cl	H			3.18
4	H	CH ₃	C ₂ H ₅	Cl	H			3.09
5	H	H	CH ₃	CF ₃	H			4.08
6	H	H	CH ₃	CF ₃	H			3.32
7	H	H	CH ₃	CF ₃	H			3.36
8	H	H	CH ₃	CF ₃	H			3.99
9	H	H	CH ₃	CF ₃	H			3.66
10	H	H	CH ₃	CF ₃	H			2.84
11	H	H	CH ₃	CF ₃	H			3.66

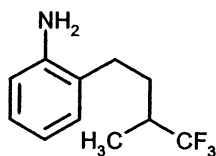
^a) 以星號(“*”)標示的鍵係與醯胺鍵連結，而以“#”標示的鍵係與鹵基烷基連結。

式(III)之起始材料之合成實例(III-1)

將7.0克的1-(2-胺基-5-氯-苯基)-4,4,4-三氟-3-甲基丁-1-酮(26毫莫耳)，4.0克的氫氧化鉀(60毫莫耳)與3.0克的聯胺水合物(60毫莫耳)溶解於67毫升的三乙二醇所成之溶液，在210°C下加熱經6小時，冷卻至室溫，加入水與乙酸乙酯，分層後，有機層再經水洗，以硫酸鎂乾燥，除去溶劑。

可收得4.9克的4-氯-2-(4,4,4-三氟-3-甲基丁基)-苯基胺(73%理論的收量)。

^1H NMR (DMSO): $\delta = 6.93$ (m, 2 H), 6.62 (d, 1 H), 5.05 (s, 2 H), 2.56 (m, 1 H), 2.48-2.34 (m, 2 H), 1.85 (m, 1 H), 1.47 (m, 1 H), 1.11 (d, 3 H)。

實例(III-2)

在室溫下攪拌溶解於21毫升甲醇之2.3克的4-氯-2-(4,4,4-三氟-3-甲基丁基)-苯基胺(III-1) (9毫莫耳)，1.15

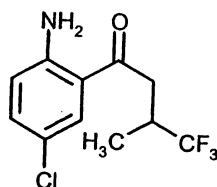
克的甲酸銨(18毫莫耳)與2.0克的Pd/C (5%，0.9毫莫耳)的溶液經1小時，其後，經由Celite將反應溶液進行吸引過濾，經甲醇洗滌並將濾液進行旋轉濃縮，將殘留物攪拌入戊烷，除去溶劑後可得固體，將其乾燥。

5 可製得1.7克的2-(4,4,4-三氟-3-甲基丁基)-苯基胺(86% 理論的收量)。

^1H NMR (DMSO): δ = 6.89 (m, 2 H), 6.61 (m, 1 H), 6.49 (m, 1 H), 4.83 (s, 2 H), 2.57 (m, 1 H), 2.48-2.30 (m, 2 H), 1.85 (m, 1 H), 1.46 (m, 1 H), 1.13 (d, 3 H)。

式(V)之起始材料之合成

實例(V-1)



15 將10.0克(29毫莫耳)的N-[4-氯-2-(4,4,4-三氟-3-甲基丁醯基)-苯基]-2,2-二甲基丙醯胺溶解於366毫升，37%鹽酸，加熱迴流二天，冷卻至室溫後，以45%氫氧化鈉溶液中中和並
20 並以二氯甲烷萃取，有機層經硫酸鈉乾燥，除去溶劑後，可製得7.1克的 1-(2-胺基-5-氯苯基)-4,4,4-三氟-3-甲基-丁烷-1-酮(93% 理論的收量)。

25 ^1H NMR (DMSO): δ = 7.80 (d, 1 H), 7.34 (s, 2 H), 7.29 (dd, 1 H), 6.82 (dd, 1 H), 3.28 (dd, 1 H), 3.14 (dd, 1 H) 3.00 (m, 1 H), 1.08 (d, 3 H)。

CC(C)(C)C(=O)Nc1ccc(Cl)cc1C(=O)CC(C)C(F)(F)F

供酸性範圍(pH 2.3)測量的流洗液為：0.1%磷酸水溶

液，乙腈；10%乙腈至90%%乙腈之線型梯度。

校準是以具已知logP值之未分枝的烷基-2-酮類(具有3至16個碳原子)進行(基於滯留時間，藉由線性內插法測定介於連續兩烷基酮類之logP值)。

- 5 $\lambda_{\max}$ 值是測自200奈米至400奈米的UV光譜之色層分析的訊號頂峰。

● 應用實例

實例A

- 10 單絲殼(*Sphaerotheca*)試驗(黃瓜)/保護性

溶劑：24.5份重的丙酮

24.5份重的二甲基乙醯胺

乳化劑：1份重的烷基芳基聚甘醇醚

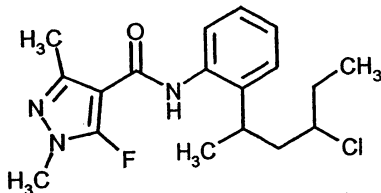
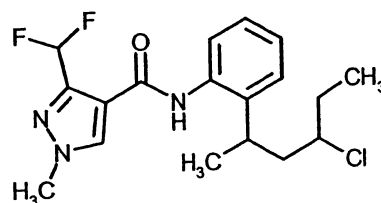
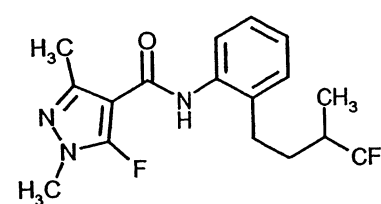
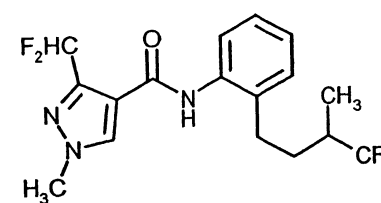
- 15 為產生適當的活性化合物之調配劑，將一份重的活性物與與所述量的溶劑及乳化劑混合，並以水將此濃縮物稀釋至所要濃度。

- 為探討保護的有效性，以所要的特定量之活性組成分調配劑噴灑於幼年黃瓜植物上，待噴灑液乾燥附著於植物上後，對植物接種上紅豆白粉病菌(*Sphaerotheca fuliginea*)的水性孢子懸浮液，然後將植物置於溫度約為23°C、相對濕度約為70%之溫室中。
- 20

於接種後第7天進行評估，0% 的活性值相當於對照組之活性，而100% 代表沒有發現受感染。

表 A

單絲殼試驗(黃瓜) / 保護性

根據本發明之活性物質	活性物質的施用率 (克/公頃)	有效程度(%)
	100	95
	100	100
	100	100
	100	98

實例B

黑星菌(*Venturia*)試驗(蘋果)/保護性

溶劑：24.5 份重的丙酮

24.5 份重的二甲基乙醯胺

5 乳化劑：1.0 份重的烷基芳基聚甘醇醚

為產生適當的活性化合物之調配劑，將一份重的活性物質與所述量的溶劑及乳化劑混合，並以水將此濃縮物稀釋至所要濃度。

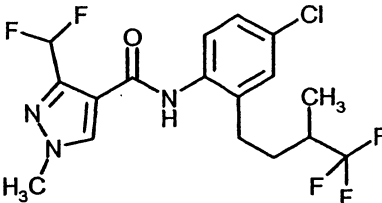
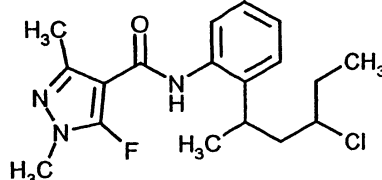
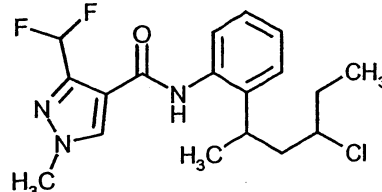
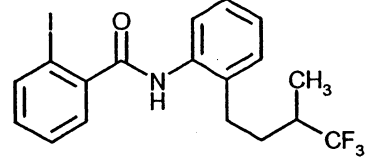
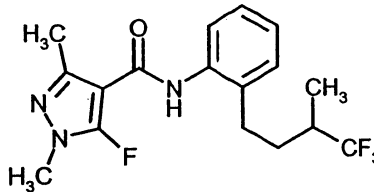
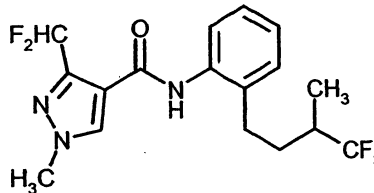
10 為測試保護的有效性，以所要的特別量之活性組成分調配劑噴灑於植物幼苗上，待噴灑塗層乾後，將植物接種上蘋果黑星病原菌(*Venturia inaequalis*)的水性分生孢子之水懸浮液，然後置於溫度為約20℃、相對濕度為100%之培養室中經一天。

15 其後將植物移至溫度為約21℃，且相對的大氣濕度為約90%之溫室中。

於接種後第10天進行評估，0% 的活性值代表相當於對照組之活性值，而100% 代表沒有發現受感染。

表 B

黑星菌(Venturia)試驗(蘋果)/保護性

根據本發明之活性物質	活性物質的施用率 (克/公頃)	有效程度(%)
	100	93
	100	100
	100	100
	100	94
	100	94
	100	97

實例 C

灰黴菌屬 (*Botrytis*) 試驗 (豆莢) / 保護性

溶劑：24.5 份重的丙酮

24.5 份重的二甲基乙醯胺

5 乳化劑：1.0 份重的烷基芳基聚甘醇醚

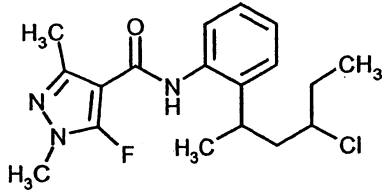
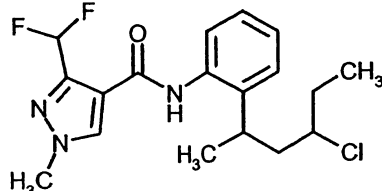
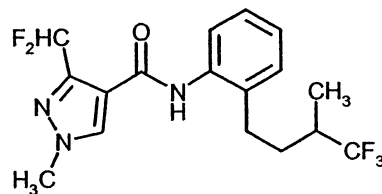
為產生適當的活性化合物之調配劑，將一份重的活性物質與所述量的溶劑及乳化劑混合，並以水將此濃縮物稀釋至所要濃度。

10 為探討保護的活性，以所要的特別量之活性組成分的調配劑噴灑於植物幼苗上，待噴灑塗層乾後，將兩小片帶有培養的灰葡萄孢 (*Botrytis cinerea*) 的洋菜置葉子上，將被接種的植物置於溫度為約 20°C、相對濕度為 100% 之暗室中。

15 於接種 2 天後，評估在葉子上感染點之大小，0% 的有效性代表相當於對照組之值，而 100% 代表沒有發現受感染。

表 C

灰黴菌屬(*Botrytis*)試驗(豆莢) / 保護性

根據本發明之活性物質	活性物質的施用率 (克/公頃)	有效程度(%)
	500	82
	500	100
	500	99

實例D

銹菌(puccinia)試驗(小麥)/保護性

溶劑：50份重的二甲基乙醯胺

乳化劑：1份重的烷基芳基聚甘醇醚

5

為產生適當的活性化合物之調配劑，將一份重的活性物質與所述量的溶劑及乳化劑混合，並以水將此濃縮物稀釋至所要濃度。

10

為探討保護的活性，以所要的特別量之活性組成分的調配劑噴灑於植物幼苗上，待噴灑塗層乾後，植物被噴灑上小麥赤銹病菌(*Puccinia recondita*)的分生孢子懸浮液，將植物置於溫度為約20°C、相對濕度為100%之培養室中，經48小時。

15

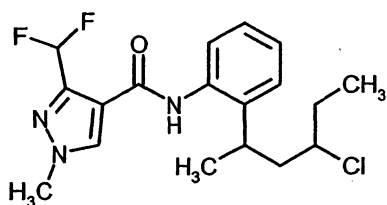
然後將植物移置至溫度為約20°C且相對濕度為80%之溫室中，以便銹菌斑點之發展。

評估是在接種後10天進行，評估在葉子上感染點之大小，0%的有效性代表相當於對照組之值，而100%代表沒有發現受感染。

表 D

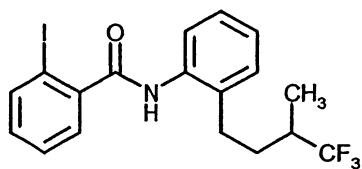
銹菌(puccinia)試驗(小麥) / 保護性

根據本發明之活性物質	活性物質的施用率 (克/公頃)	有效程度(%)
------------	--------------------	---------



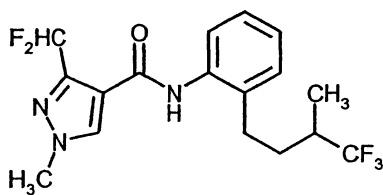
500

100



500

100



500

100

實例 E

交鏈孢菌屬(*Alternaria*)試驗(蕃茄)/保護性

溶劑：49 份重的二甲基乙醯胺

乳化劑：1 份重的烷基芳基聚甘醇醚

5

為產生適當的活性化合物之調配劑，將一份重的活性化合物與所述量的溶劑及乳化劑混合，並以水將此濃縮物稀釋至所要濃度。

10

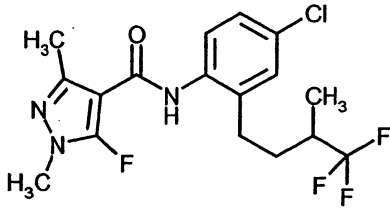
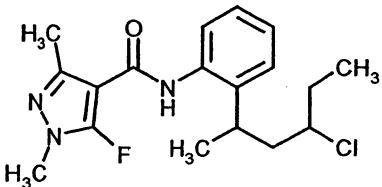
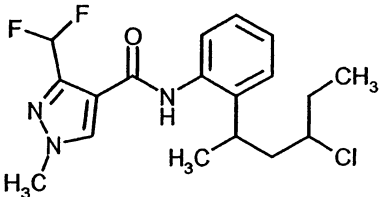
為探討保護的活性，以所要的特別量之活性化合物的調配劑噴灑於蕃茄幼苗上，處理一天後後，植物被接種上蕃茄早疫病(*Alternaria solani*)之孢子水性懸浮液，然後將植物置於溫度為約20°C、相對濕度為100%之培養室中，經24小時，接著將植物置於相對濕度為96%而溫度為20°C下。

15

於接種7天後進行評估，0% 的有效程度代表相當於對照組之活性值，而100% 代表沒有發現受感染。

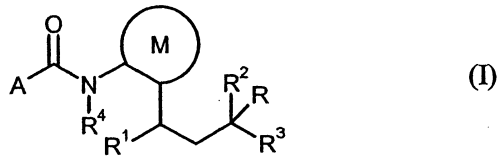
表 E

交鏈孢菌屬(*Alternaria*)試驗(蕃茄)/保護性

根據本發明之活性物質	活性物質的施用率 (克/公頃)	有效程度(%)
	750	90
	750	100
	750	95

五、中文發明摘要：

新穎的具式(I)之鹵烷基羧醯胺類



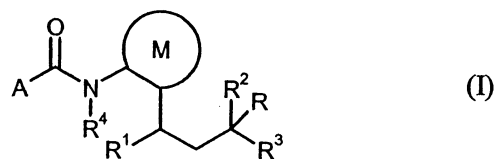
其中

● R, R¹, R², R³, R⁴, M 與 A 具有如說明書中所界定的含義，

10 合成這些材料的許多過程及使用其用於對抗不想要的微生物的用途，以及新穎的中間產物及其合成法。

六、英文發明摘要：

New haloalkyl carboxamides of the formula (I)



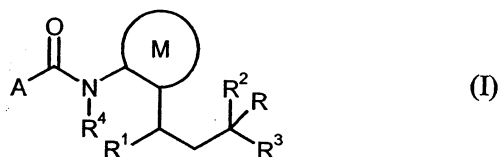
in which

20 R, R¹, R², R³, R⁴, M and A have the meanings specified in the description,

several processes for synthesizing these materials and their use in combating undesirable microorganisms, as well as new intermediate products and their synthesis.

十、申請專利範圍：

1. 一種式(I)之鹵基烷基羧醯胺類



其中

R 代表氫或鹵素，

R¹ 代表氫或甲基，

R² 代表甲基，乙基或具有1至9個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₄鹵基烷基，

R³ 代表鹵素或具有1至9個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₄鹵基烷基，

R⁴ 代表氫，C₁-C₈烷基，C₁-C₆烷基亞磺醯基，C₁-C₆烷基磺醯基，C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，C₃-C₈環烷基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₆鹵基烷基，C₁-C₄鹵基烷硫基，C₁-C₄鹵基烷基亞磺醯基，C₁-C₄鹵基烷基磺醯基，鹵基-C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之C₃-C₈鹵基環烷基；甲醯基，甲醯基-C₁-C₃-烷基，(C₁-C₃-烷基)羰基-C₁-C₃-烷基，(C₁-C₃-烷氧基)羰基-C₁-C₃-烷基；各具有1至13個氟，氯及/或溴原子之鹵基-(C₁-C₃烷基)羰基-C₁-C₃-烷基，鹵基-(C₁-C₃烷氧基)羰基-C₁-C₃-烷基；

(C₁-C₈烷基)羰基，(C₁-C₈烷氧基)羰基，(C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基)羰基，(C₃-C₈環烷基)羰基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之(C₁-C₆鹵基烷基)羰基，(C₁-C₆鹵基烷氧基)羰基，(鹵基-C₁-C₄烷氧基-C₁-C₄-烷基)羰基，(C₃-C₈鹵基環烷基)羰基；或
 $-C(=O)C(=O)R^5$ ， $-CONR^6R^7$ 或 $-CH_2NR^8R^9$ ，

R⁵ 代表氫，C₁-C₈烷基，C₁-C₈烷氧基，C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，C₃-C₈環烷基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₆鹵基烷基，C₁-C₆鹵基烷氧基，鹵基-C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，C₃-C₈鹵基環烷基，

R⁶與R⁷彼此獨立地各代表氫，C₁-C₈烷基，C₁-C₄-烷氧基C₁-C₄-烷基，C₃-C₈環烷基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₈鹵基烷基，鹵基-C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，C₃-C₈鹵基環烷基，

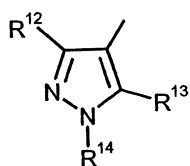
R⁶與R⁷另外，可與其附接的氮原子形成一種經取代的、飽和的、具有5至8個環原子之雜環，帶有一或多個、相同或相異的鹵素或C₁-C₄烷基之取代基，其中的雜環可再含有1或2個、非相鄰的選自氧、硫或NR¹⁰之雜原子，

R⁸與R⁹彼此獨立地代表氫，C₁-C₈-烷基，C₃-C₈環烷基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₈鹵基烷基，C₃-C₈鹵基環烷基，

R⁸與R⁹另外，可與其附接的氮原子形成一種經取代的、

飽和的、具有5至8個環原子之雜環，帶有一或多個、相同或相異的鹵素或C₁-C₄烷基之取代基，其中的雜環可再含有1或2個、非相鄰的選自氧、硫或NR¹⁰之雜原子，

- 5 R¹⁰ 代表氫或C₁-C₆烷基，
- M 各情形下代表苯基，吡啶或嘓啶，具有單取代基R¹¹的噻吡或吡吡環或代表經R^{11-A}取代的噻唑環，
- R¹¹ 代表氫，氟，氯，甲基，異丙基，甲硫基或三氟甲基，
- 10 R^{11-A} 代表氫，甲基，甲硫基或三氟甲基，
- A 代表式(A1)之基



(A1)，其中

- 15
- R¹² 代表氫，氰基，鹵素，硝基，C₁-C₄烷基，C₁-C₄烷氧基，C₁-C₄烷硫基，C₃-C₆環烷基，各具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄鹵基烷基，C₁-C₄鹵基烷氧基或C₁-C₄鹵基烷硫基，胺基羰基或胺基羰基-C₁-C₄-烷基，
- 20 R¹³ 代表氫，鹵素，氰基，C₁-C₄烷基，C₁-C₄烷氧基或C₁-C₄烷硫基，
- R¹⁴ 代表氫，C₁-C₄烷基，羥基-C₁-C₄烷基，C₂-C₆烯基，C₃-C₆環烷基，C₁-C₄-烷硫基-C₁-C₄-烷

基， C_1-C_4 -烷氧基- C_1-C_4 -烷基，各具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_4 鹵基烷基， C_1-C_4 -鹵基烷硫基- C_1-C_4 -烷基， C_1-C_4 -鹵基烷氧基- C_1-C_4 -烷基，或苯基，

5 或

A 代表式(A2)之基



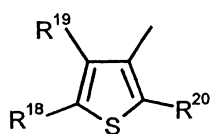
(A2)，其中

10 R^{15} 與 R^{16} 彼此獨立地代表氫，鹵素， C_1-C_4 烷基或具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_4 鹵基烷基，

R^{17} 代表鹵素，氰基或 C_1-C_4 烷基，或各具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_4 鹵基烷基或 C_1-C_4 鹵基烷氧基，

15 或

A 代表式(A3)之基



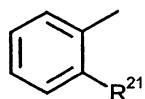
(A3)，其中

20 R^{18} 與 R^{19} 彼此獨立地代表氫，鹵素， C_1-C_4 烷基或具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_4 鹵基烷基，

R^{20} 代表氫，鹵素， C_1-C_4 烷基或具有1至5個鹵素原子之 C_1-C_4 鹵基烷基，

或

A 代表式(A4)之基



(A4)，其中

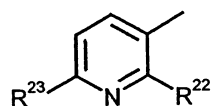
5

R^{21} 代表氫，鹵素，羥基，氰基， C_1 - C_6 烷基，各具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基， C_1 - C_4 鹵基烷氧基或 C_1 - C_4 鹵基烷硫基，

或

A 代表式(A5)之基

10



(A5)，其中

15

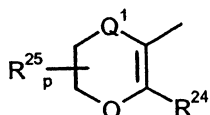
R^{22} 代表鹵素，羥基，氰基， C_1 - C_4 烷基， C_1 - C_4 烷氧基， C_1 - C_4 烷硫基，各具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基， C_1 - C_4 鹵基烷硫基或 C_1 - C_4 鹵基烷氧基，

R^{23} 代表氫，鹵素，氰基， C_1 - C_4 烷基， C_1 - C_4 烷氧基， C_1 - C_4 烷硫基，各具有1至5個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基， C_1 - C_4 鹵基烷氧基， C_1 - C_4 烷基亞磺基或 C_1 - C_4 烷基磺基，

20

或

A 代表式(A6)之基



(A6)，其中

R^{24} 代表 C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

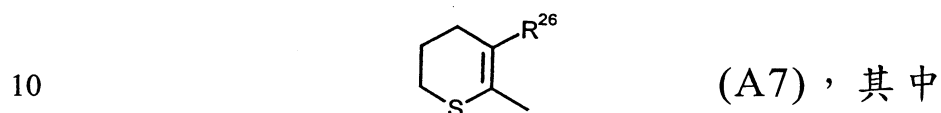
R^{25} 代表 C_1 - C_4 烷基，

Q^1 代表 S (硫)，O (氧)，SO， SO_2 ，或 CH_2 ，

5 p 代表 0，1 或 2，其中如果 p 為 2， R^{25} 代表相同或多種的基團，

或

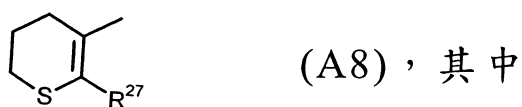
A 代表式 (A7) 之基



R^{26} 代表 C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子 C_1 - C_4 鹵基烷基，

或

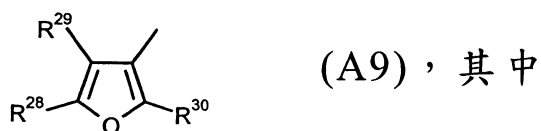
15 A 代表式 (A8) 之基



20 R^{27} 代表 C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

或

A 代表式 (A9) 之基

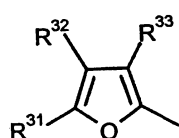


R^{28} 與 R^{29} 彼此獨立地代表氫，鹵素，胺基， C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

R^{30} 代表氫，鹵素， C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

或

A 代表式 (A10) 之基



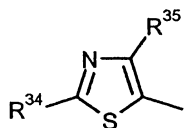
(A10)，其中

R^{31} 與 R^{32} 彼此獨立地代表氫，鹵素，胺基，硝基， C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

R^{33} 代表氫，鹵素， C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

或

A 代表式 (A11) 之基



(A11)，其中

R^{34} 代表氫，鹵素，胺基， C_1 - C_4 烷基胺基，二- $(C_1$ - C_4 烷基)胺基，氰基， C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子 C_1 - C_4 鹵基烷基，

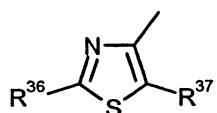
R^{35} 代表鹵素， C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子

之C₁-C₄鹵基烷基，

或

A 代表式(A12)之基

5



(A12)，其中

R³⁶ 代表氫，鹵素，胺基，C₁-C₄烷基胺基，二-(C₁-C₄烷基)胺基，氰基，C₁-C₄烷基或具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄鹵基烷基，

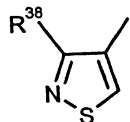
10

R³⁷ 代表鹵素，C₁-C₄烷基或具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄鹵基烷基，

或

A 代表式(A13)之基

15



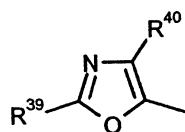
(A13)，其中

R³⁸ 代表鹵素，C₁-C₄烷基或具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄鹵基烷基，

或

20

A 代表式(A14)之基



(A14)，其中

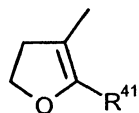
R³⁹ 代表氫或C₁-C₄烷基，

R^{40} 代表鹵素或 C_1 - C_4 烷基，

或

A 代表式 (A15) 之基

5



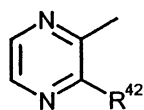
(A15)，其中

R^{41} 代表 C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

或

10

A 代表式 (A16) 之基



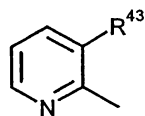
(A16)，其中

R^{42} 代表氫，鹵素， C_1 - C_4 烷基或具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基，

15

或

A 代表式 (A17) 之基



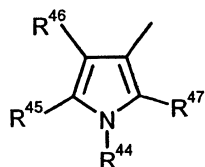
(A17)，其中

20

R^{43} 代表鹵素，羥基， C_1 - C_4 烷基， C_1 - C_4 烷氧基， C_1 - C_4 烷硫基，各具有 1 至 5 個鹵素原子之 C_1 - C_4 鹵基烷基， C_1 - C_4 鹵基烷硫基或 C_1 - C_4 鹵基烷氧基，

或

A 代表式(A18)之基



(A18), 其中

R⁴⁴ 代表氫，氰基，C₁-C₄烷基，具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄鹵基烷基，C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄烷基，羥基-C₁-C₄烷基，C₁-C₄烷基磺醯基，二(C₁-C₄烷基)胺基磺醯基，C₁-C₆烷基羰基或各可經取代之苯基磺醯基或苯甲醯基，

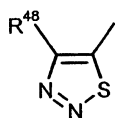
R⁴⁵ 代表氫，鹵素，C₁-C₄烷基或具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄鹵基烷基，

R⁴⁶ 代表氫，鹵素，氰基，C₁-C₄烷基或具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄鹵基烷基，

R⁴⁷ 代表氫，鹵素，C₁-C₄烷基或具有1至5個鹵素原子之C₁-C₄鹵基烷基，

或

A 代表式(A19)之基



(A19), 其中

R⁴⁸ 代表C₁-C₄烷基。

2. 根據申請專利範圍第1項的式(I)之鹵烷基羧醯胺類，其

中

R 代表氫，氟，氯或溴，

R¹ 代表氫或甲基，

R² 代表甲基，乙基或各具單個或多個、相同或相異的氟，氯或溴為取代基之甲基，乙基，正-或異丙基，正-、異-、第二-或第三-丁基，

R³ 代表氟，氯，溴，碘或各具單個或多個、相同或相異的氟，氯或溴為取代基之甲基，乙基，正-或異丙基，正-，異-，第二-或第三-丁基，

R⁴ 代表氫，C₁-C₄烷基，C₁-C₄烷基亞磺基，C₁-C₄烷基磺基，C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基，C₃-C₆環烷基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₄鹵基烷基，C₁-C₄鹵基烷硫基，C₁-C₄鹵基烷基亞磺基，C₁-C₄鹵基烷基磺基，鹵基-C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基，C₃-C₈鹵基環烷基；甲磺基，甲磺基-C₁-C₃-烷基，(C₁-C₃-烷基)羰基-C₁-C₃-烷基，(C₁-C₃-烷氧基)羰基-C₁-C₃-烷基；各具有1至13個氟，氯及/或溴原子之鹵基-(C₁-C₃烷基)羰基-C₁-C₃-烷基，鹵基-(C₁-C₃烷氧基)羰基-C₁-C₃-烷基；

(C₁-C₆烷基)羰基，(C₁-C₄烷氧基)羰基，(C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基)羰基，(C₃-C₆環烷基)羰基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之(C₁-C₄鹵基烷基)羰基，(C₁-C₄鹵基烷氧基)羰基，(鹵基-C₁-C₃-烷氧基

-C₁-C₃-烷基)羰基，(C₃-C₆鹵基環烷基)羰基；或
 -C(=O)C(=O)R⁵，-CONR⁶R⁷或-CH₂NR⁸R⁹，

R⁵ 代表氫，C₁-C₆烷基，C₁-C₄烷氧基，C₁-C₃-烷氧基
 -C₁-C₃-烷基，C₃-C₆環烷基；各具有1至9個氟，氯
 5 及/或溴原子之C₁-C₄鹵基烷基，C₁-C₄鹵基烷氧
 基，鹵基-C₁-C₃-烷氧基-C₁-C₃-烷基，C₃-C₆鹵基環
 烷基，

R⁶與R⁷彼此獨立地代表氫，C₁-C₆烷基，C₁-C₃-烷氧基
 -C₁-C₃-烷基，C₃-C₆環烷基；各具有1至9個氟，氯
 10 及/或溴原子之C₁-C₄鹵基烷基，鹵基-C₁-C₃-烷氧基
 -C₁-C₃-烷基，C₃-C₆鹵基環烷基，

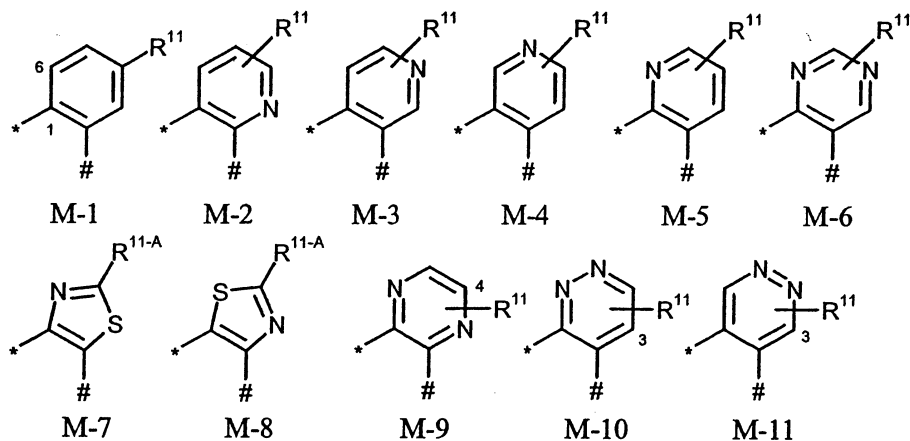
R⁶與R⁷，另外，與其附接的氮原子形成一種經取代的、
 飽和的具有5至8個環原子之雜環，其可帶有一個
 或多個、相同或相異的鹵素或C₁-C₄烷基之取代
 15 基，其中的雜環可再含有1或2個額外的，非鄰接
 的選自氧、硫或NR¹⁰之雜原子，

R⁸與R⁹彼此獨立地代表氫，C₁-C₆烷基，C₃-C₆環烷基；
 各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₄鹵基烷
 基，C₃-C₆鹵基環烷基，

R⁸與R⁹，另外，與其附接的氮原子形成一種經取代的、
 飽和的具5至8個環原子之雜環，其可帶有一或多
 20 個、相同或相異的鹵素或C₁-C₄烷基為取代基，其
 中的雜環可再含有1或2個額外的，非鄰接的選自
 氧、硫或NR¹⁰之雜原子，

R^{10} 代表氫或 C_1 - C_4 烷基，

M 代表下列環之一

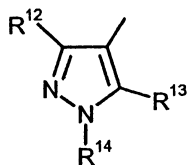


其中以星號("*")標示的鍵係與醯胺相連，而以"#"標示的鍵則係連至鹵基烷基之基團，

R^{11} 代表氫，氟，氯，甲基或三氟甲基，

R^{11-A} 代表氫，甲基或三氟甲基，

A 代表式(A1)之基



(A1)，其中

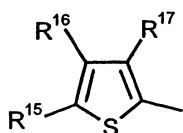
R^{12} 代表氫，氰基，氟，氯，溴，碘，甲基，乙基，異丙基，甲氧基，乙氧基，甲硫基，乙硫基，環丙基，具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基， C_1 - C_2 鹵基烷氧基，三氟甲硫基，二氟甲硫基，胺基羰基，胺基羰基甲基或胺基羰基乙基，

R^{13} 代表氫，氟，氯，溴，碘，甲基，乙基，甲氧基，乙氧基，甲硫基或乙硫基。

R^{14} 代表氫，甲基，乙基，正-丙基，異丙基，具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基，羥基甲基，羥基乙基，環丙基，環戊基，環己基或苯基，

或

A 代表式(A2)之基



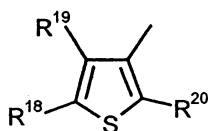
(A2)，其中

R^{15} 與 R^{16} 彼此獨立地代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基，

R^{17} 代表氟，氯，溴，氰基，甲基，乙基， C_1 - C_2 鹵基烷基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷氧基，

或

A 代表式(A3)之基



(A3)，其中

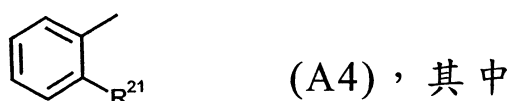
R^{18} 與 R^{19} 彼此獨立地代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷

基，

R^{20} 代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基，

或

5 A 代表式(A4)之基



10 R^{21} 代表氫，氟，氯，溴，碘，羥基，氰基， C_1 - C_4 烷基，各具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基， C_1 - C_2 鹵基烷氧基或 C_1 - C_2 鹵基烷硫基，

或

A 代表式(A5)之基

15



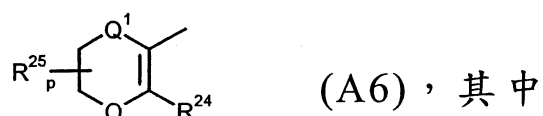
20 R^{22} 代表氟，氯，溴，碘，羥基，氰基， C_1 - C_4 烷基，甲氧基，乙氧基，甲硫基，乙硫基，二氟甲硫基，三氟甲硫基，各具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基或 C_1 - C_2 鹵基烷氧基。

R^{23} 代表氫，氟，氯，溴，碘，氰基， C_1 - C_4 烷基，甲氧基，乙氧基，甲硫基，乙硫基，各具有1

至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基或
C₁-C₂鹵基烷氧基，C₁-C₂烷基亞磺醯基或
C₁-C₂烷基磺醯基，

或

5 A 代表式(A6)之基



10 R²⁴ 代表甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴
原子之C₁-C₂鹵基烷基，

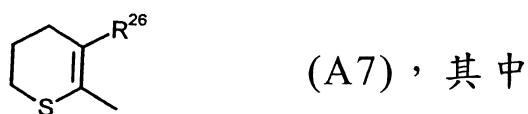
R²⁵ 代表甲基或乙基，

Q¹ 代表S (硫)，SO₂或CH₂，

p 代表0或1，

或

15 A 代表式(A7)之基



20 R²⁶ 代表甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴
原子之C₁-C₂鹵基烷基，

或

A 代表式(A8)之基

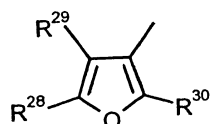


R^{27} 代表甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1-C_2 鹵基烷基，

或

A 代表式(A9)之基

5



(A9)，其中

R^{28} 與 R^{29} 彼此獨立地代表氫，氟，氯，溴，胺基，
甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子
之 C_1-C_2 鹵基烷基，

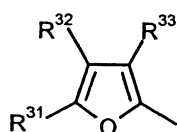
10

R^{30} 代表氫，氟，氯，溴，碘，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1-C_2 鹵基烷基，

或

15

A 代表式(A10)之基



(A10)，其中

R^{31} 與 R^{32} 彼此獨立地代表氫，氟，氯，溴，胺基，
硝基，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或
溴原子之 C_1-C_2 鹵基烷基，

20

R^{33} 代表氫，氟，氯，溴，碘，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1-C_2 鹵基烷基，

或

A 代表式(A11)之基



(A11), 其中

5

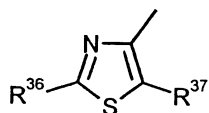
R^{34} 代表氫，氟，氯，溴，胺基， C_1 - C_4 烷基胺基，二(C_1 - C_4 烷基)胺基，氰基，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基，

10

R^{35} 代表氟，氯，溴，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基，

或

A 代表式(A12)之基



(A12), 其中

15

R^{36} 代表氫，氟，氯，溴，胺基， C_1 - C_4 烷基胺基，二(C_1 - C_4 烷基)胺基，氰基，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基，

20

R^{37} 代表氟，氯，溴，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基。

或

A 代表式(A13)之基

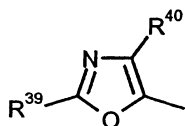


(A13), 其中

R^{38} 代表氟, 氯, 溴, 甲基, 乙基或具有1至5個
 5 氟, 氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基,

或

A 代表式(A14)之基



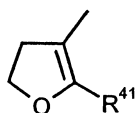
(A14), 其中

R^{39} 代表氫, 甲基或乙基,

R^{40} 代表氟, 氯, 溴, 甲基或乙基,

或

A 代表式(A15)之基

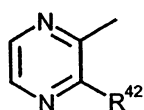


(A15), 其中

R^{41} 代表甲基, 乙基或具有1至5個氟, 氯及/或溴
 20 原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基,

或

A 代表式(A16)之基



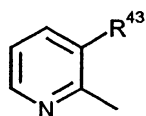
(A16), 其中

R^{42} 代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基，

或

A 代表式(A17)之基

5



(A17)，其中

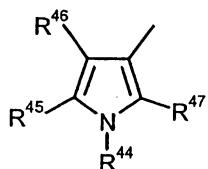
R^{43} 代表氟，氯，溴，碘，羥基， C_1 - C_4 烷基，甲氧基，乙氧基，甲硫基，乙硫基，二氟甲硫基，三氟甲硫基，各具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基或 C_1 - C_2 鹵基烷氧基，

10

或

A 代表式(A18)之基

15



(A18)，其中

R^{44} 代表氫，甲基，乙基，具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基， C_1 - C_4 烷氧基- C_1 - C_4 -烷基，羥基甲基，羥基乙基，甲基磺醯基或二甲基胺基磺醯基，

20

R^{45} 代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基或各具有1至5個氟，氯及/或溴原子之 C_1 - C_2 鹵基烷基，

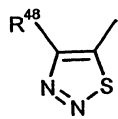
R^{46} 代表氫，氟，氯，溴，碘，氰基，甲基，乙

基，異丙基或各具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基，

R⁴⁷ 代表氫，氟，氯，溴，甲基，乙基或具有1至5個氟，氯及/或溴原子之C₁-C₂鹵基烷基，

5 或

A 代表式(A19)之基



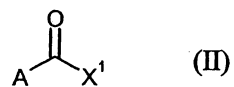
(A19)，其中

10 R⁴⁸ 代表甲基，乙基，正-丙基或異丙基。

3. 一種供合成根據申請專利範圍第1項的式(I)之鹵烷基羧
醯胺類的方法，特徵為

a) 式(II)的羧酸衍生物類

15



(II)

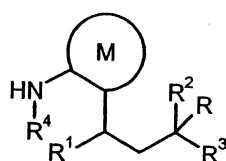
其中

A 具有於申請專利範圍第1項主張中說明的含義
且

20

X¹ 代表鹵素或羥基，

被與式(III)的苯胺衍生物反應



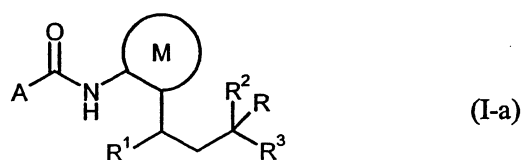
(III)

其中R, R¹, R², R³, R⁴與M具有於申請專利範圍第1項主張中說明的含義,

可能地在催化劑存在下, 可能地在縮合劑存在下, 可能地在酸結合劑存在下及可能地在稀釋劑存在下進行,

或

b) 令式(I-a)之己基甲醯苯胺類



其中R, R¹, R², R³, M與A具有於申請專利範圍第1項主張中說明的含義,

與式(IV)的鹵化物類反應



其中

X² 代表氯, 溴或碘,

R^{4-A} 代表C₁-C₈烷基, C₁-C₆烷基亞磺醯基, C₁-C₆烷基磺醯基, C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基, C₃-C₈環烷基; 各具有1至9個氟, 氯及/或溴原子之C₁-C₆鹵基烷基, C₁-C₄鹵基烷硫基, C₁-C₄鹵基烷基亞磺醯基, C₁-C₄鹵基烷基磺醯基, 鹵基-C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基, C₃-C₈鹵基環烷基; 甲醯基, 甲醯基-C₁-C₃-烷基, (C₁-C₃-烷

基)羰基-C₁-C₃-烷基，(C₁-C₃-烷氧基)羰基-C₁-C₃-烷基；各具有1至13個氟，氯及/或溴原子之鹵基-C₁-C₃-烷基)羰基-C₁-C₃-烷基，鹵基-(C₁-C₃烷氧基)羰基-C₁-C₃-烷基；

(C₁-C₈烷基)羰基，(C₁-C₈烷氧基)羰基，(C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基)羰基，(C₃-C₈環烷基)羰基；各具有1至9個氟，氯及/或溴原子之(C₁-C₆鹵基烷基)羰基，(C₁-C₆鹵基烷氧基)羰基，(鹵基-C₁-C₄-烷氧基-C₁-C₄-烷基)羰基，(C₃-C₈鹵基環烷基)羰基；或-C(=O)C(=O)R⁵，-CONR⁶R⁷或-CH₂NR⁸R⁹，

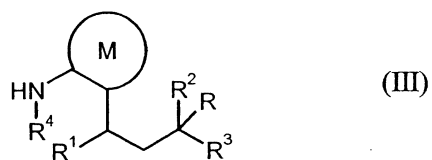
其中R⁵，R⁶，R⁷，R⁸與R⁹具有於申請專利範圍第1項主張中說明的含義，

係在鹼存在下與稀釋介質存在下進行。

4. 一種供對抗不想要的微生物之媒質，特徵為其中包含至少一種根據申請專利範圍第1項的式(I)之鹵烷基羧醯胺類與展延劑及/或介面-活性材料。
5. 一種使用根據申請專利範圍第1項的式(I)之鹵烷基羧醯胺類供對抗不想要的微生物之用途。
6. 一種供對抗不想要的微生物之方法，特徵為將根據申請專利範圍第1項的式(I)之鹵烷基羧醯胺類施加至微生物及/或其生長的环境。
7. 一種供合成用於控制不想要的微生物之材料的方法，特徵為將根據申請專利範圍第1項的式(I)之鹵烷基羧醯胺

類與展延劑及/或介面-活性材料混合。

8. 一種式(III)之苯胺類



其中 R，R¹，R²，R³，R⁴ 與 M 具有於申請專利範圍第 1 項主張中說明的含義。

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：

無