

200538040

# 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：94103486

※ 申請日期：94.2.4

※IPC 分類：

一、發明名稱：(中文/英文)

A01N 37/18

羧醯胺類

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.赫史芬/HERRMANN, STEFAN

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；102004005787.7

☐ 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；102004005787.7

☐ 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】

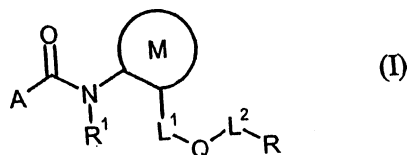
本發明係有關一種新穎羧醯胺類，及合成此等化合物之多種方法及其於控制不要之微生物上之用途。

### 【先前技術】

已知多種羧醯胺類具有殺真菌劑性質(參見例如：WO 03/010149、WO 02/059086、EP-A 0 824 099、EP-A 0 737 682、EP-A 0 591 699、EP-A 0589301、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)。因此已知其中有許多烷基羧醯胺之烷基部份未經取代，如，例如：來自 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、來自 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-羧醯胺與來自 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。此等物質之有效性良好，但許多時候之效力仍嫌不足，例如：低施用率時。

### 【發明內容】

已發現新穎之式(I)羧醯胺



其中

$R^1$  代表氫、 $C_1-C_8$  烷基、 $C_1-C_6$  烷基亞磺基、 $C_1-C_6$  烷基磺基、 $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_8$  環烷基； $C_1-C_6$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷硫基、 $C_1-C_4$  鹵烷基-亞磺基、 $C_1-C_4$  鹵烷基磺基、鹵- $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_8$  鹵環烷基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子；甲

基、甲基- $C_1-C_3$ -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；鹵-( $C_1-C_3$ -烷基)羰基- $C_1-C_3$ -烷基、鹵-( $C_1-C_3$ -烷氧基)羰基- $C_1-C_3$ -烷基，其分別含有 1 至 13 個氟、氯與/或溴原子；

( $C_1-C_8$ -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；( $C_1-C_6$ -鹵烷基)羰基、( $C_1-C_6$ -鹵烷氧基)羰基、(鹵- $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基)羰基、( $C_3-C_8$ -鹵環烷基)羰基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子；或- $C(=O)C(=O)R^2$ 、- $CONR^3R^4$  或- $CH_2NR^5R^6$ ，

$R^2$  代表氫、 $C_1-C_8$  烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_8$  環烷基； $C_1-C_6$  鹵烷基、 $C_1-C_6$  鹵烷氧基、鹵- $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_8$  鹵環烷基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子，

$R^3$  與  $R^4$  分別獨立代表氫、 $C_1-C_8$  烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_8$  環烷基； $C_1-C_8$  鹵烷基、鹵- $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_8$  鹵環烷基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子，

$R^3$  與  $R^4$  亦可與其所附接之氮原子共同形成經取代之飽和雜環，其具有 5 至 8 個環原子，且經相同或相異之鹵素或  $C_1$ - $C_4$  烷基取代一次或多次，其中該雜環可另包含 1 或 2 個由氧、硫或  $NR^7$  構成之不相鄰雜原子，

$R^5$  與  $R^6$  分別獨立代表氫、 $C_1$ - $C_8$ -烷基、 $C_3$ - $C_8$  環烷基； $C_1$ - $C_8$  鹵烷基、 $C_3$ - $C_8$  鹵環烷基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子，

$R^5$  與  $R^6$  亦可與其所附接之氮原子共同形成經取代之飽和雜環，其具有 5 至 8 個環原子，且經相同或相異之鹵素或  $C_1$ - $C_4$  烷基取代一次或多次，其中該雜環可另包含 1 或 2 個由氧、硫或  $NR^7$  構成之不相鄰雜原子，

$R^7$  代表氫或  $C_1$ - $C_6$  烷基，

M 分別代表苯基、吡啶或嘧啶、經  $R^8$  單一取代之嗒吡或吡吡環或經  $R^{8-A}$  取代之噻唑環，

$R^8$  代表氫、氟、氯、甲基、異丙基、甲硫基或三氟甲基，

$R^8$  亦代表甲氧基，

$R^{8-A}$  代表氫、甲基、甲硫基或三氟甲基，

$L^1$  代表  $C_1$ - $C_{10}$  伸烷基(烷二基)，

Q 代表 O、S、SO、 $SO_2$  或  $NR^9$ ，

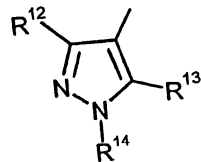
$L^2$  代表一直接鏈結、 $SiR^{10}R^{11}$  或 CO，

R 代表氫、 $C_1$ - $C_8$  烷基、 $C_1$ - $C_8$  烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ -烷氧基  $C_1$ - $C_4$ -烷基、 $C_1$ - $C_4$ -烷硫基- $C_1$ - $C_4$ -烷基、 $C_2$ - $C_8$  烯基、 $C_2$ - $C_8$  炔基、 $C_1$ - $C_6$  鹵烷基、 $C_2$ - $C_6$  鹵烯基、 $C_2$ - $C_6$  鹵炔基或  $C_3$ - $C_6$  環烷基，

$R^9$  代表氫、 $C_1$ - $C_8$  烷基、 $C_1$ - $C_4$ -烷氧基- $C_1$ - $C_4$ -烷基、 $C_1$ - $C_4$ -  
 烷硫基- $C_1$ - $C_4$ -烷基、 $C_2$ - $C_8$  烯基、 $C_2$ - $C_8$  炔基、 $C_1$ - $C_6$  鹵  
 烷基、 $C_2$ - $C_6$  鹵烯基、 $C_2$ - $C_6$  鹵炔基或  $C_3$ - $C_6$  環烷基，

$R^{10}$  與  $R^{11}$  分別獨立代表氫、 $C_1$ - $C_8$  烷基、 $C_1$ - $C_8$  烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ -  
 烷氧基- $C_1$ - $C_4$ -烷基、 $C_1$ - $C_4$ -烷硫基- $C_1$ - $C_4$ -烷基或  $C_1$ - $C_6$ -  
 鹵烷基，

A 代表式(A1)基團



(A1)，其中

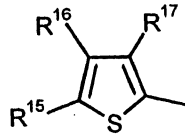
$R^{12}$  代表氫、氟基、鹵素、硝基、 $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_1$ - $C_4$   
 烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ -烷硫基、 $C_3$ - $C_6$ -環烷基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷  
 基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷氧基或  $C_1$ - $C_4$  鹵烷硫基(其分別含有  
 1 至 5 個鹵原子)、胺基羰基或胺基羰基- $C_1$ - $C_4$ -烷基，

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

$R^{14}$  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、 $C_1$ - $C_4$ -鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$ -鹵烷硫基  
 - $C_1$ - $C_4$ -烷基、 $C_1$ - $C_4$ -鹵烷氧基- $C_1$ - $C_4$ -烷基(其分別含  
 有 1 至 5 個鹵原子)、或苯基，

或

A 代表式(A2)基團



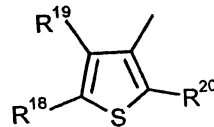
(A2), 其中

$R^{15}$  與  $R^{16}$  分別獨立代表氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

$R^{17}$  代表鹵素、氰基或  $C_1$ - $C_4$ -烷基、或  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基或  $C_1$ - $C_4$  鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5 個鹵原子)，

或

A 代表式(A3)基團



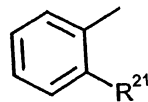
(A3), 其中

$R^{18}$  與  $R^{19}$  分別獨立代表氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

$R^{20}$  代表氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

或

A 代表式(A4)基團

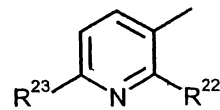


(A4), 其中

$R^{21}$  代表氫、鹵素、羥基、氰基、 $C_1$ - $C_6$ -烷基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷氧基或  $C_1$ - $C_4$  鹵烷硫基(其分別含有 1 至 5 個鹵原子)，

或

A 代表式(A5)基團



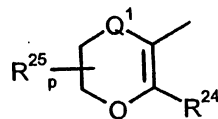
(A5), 其中

$R^{22}$  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、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷硫基或  $C_1$ - $C_4$  鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5 個鹵原子),

$R^{23}$  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、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$ -鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5 個鹵原子)、 $C_1$ - $C_4$  烷基亞磺醯基或  $C_1$ - $C_4$  烷基磺醯基,

或

A 代表式(A6)基團



(A6), 其中

$R^{24}$  代表  $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基,

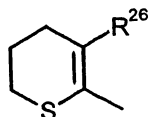
$R^{25}$  代表  $C_1$ - $C_4$  烷基,

$Q^1$  代表 S(硫)、SO、 $SO_2$  或  $CH_2$ ,

p 代表 0、1 或 2, 若 p 為 2 時, 則  $R^{25}$  代表相同或相異之基團,

或

A 代表式(A7)基團

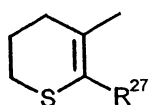


(A7), 其中

$R^{26}$  代表  $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

或

A 代表式(A8)基團

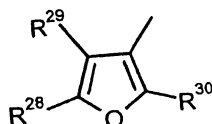


(A8)，其中

$R^{27}$  代表  $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

或

A 代表式(A9)基團



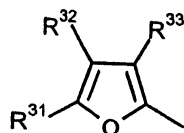
(A9)，其中

$R^{28}$  與  $R^{29}$  分別獨立代表氫、鹵素、胺基、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

$R^{30}$  代表氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

或

A 代表式(A10)基團



(A10)，其中

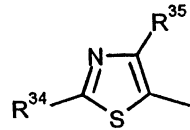
$R^{31}$  與  $R^{32}$  分別獨立代表氫、鹵素、胺基、硝基、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

$R^{33}$  代表氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子

之 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基，

或

A 代表式(A11)基團



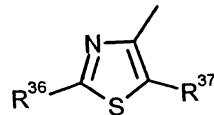
(A11)，其中

R<sup>34</sup> 代表氫、鹵素、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基胺基、二-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)胺基、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基，

R<sup>35</sup> 代表鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基，

或

A 代表式(A12)基團



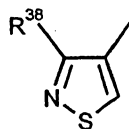
(A12)，其中

R<sup>36</sup> 代表氫、鹵素、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基胺基、二-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)胺基、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基，

R<sup>37</sup> 代表鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基，

或

A 代表式(A13)基團

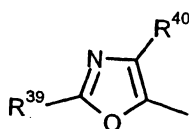


(A13), 其中

$R^{38}$  代表鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  
 $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

5 或

A 代表式(A14)基團



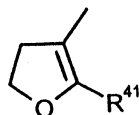
(A14), 其中

10  $R^{39}$  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)基團



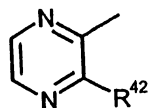
(A15), 其中

15

$R^{41}$  代表  $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

或

A 代表式(A16)基團



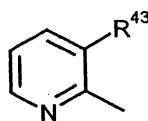
(A16), 其中

20

$R^{42}$  代表氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子  
 之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

或

A 代表式(A17)基團

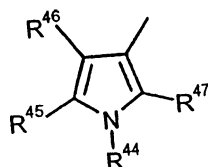


(A 17), 其中

$R^{43}$  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、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷硫基或  $C_1$ - $C_4$  鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5 個鹵原子),

或

A 代表式(A18)基團



(A18), 其中

$R^{44}$  代表氫、氰基、 $C_1$ - $C_4$  烷基、含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$ -烷氧基- $C_1$ - $C_4$  烷基、羥基- $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_1$ - $C_4$  烷基磺醯基、二( $C_1$ - $C_4$  烷基)胺基磺醯基、 $C_1$ - $C_6$  烷基羰基或分別可經取代之苯基磺醯基或苯甲醯基,

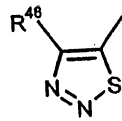
$R^{45}$  代表氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基,

$R^{46}$  代表氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基,

$R^{47}$  代表氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基,

或

A 代表式(A19)基團



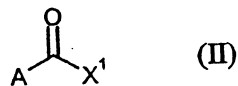
(A19), 其中

$R^{48}$  代表  $C_1$ - $C_4$  烷基,

其中若  $L^2$  為一直接鏈結時, 則 R 不為烷氧基。

此外, 已發現式(I)羧醯胺係由

(a) 式(II)羧酸衍生物

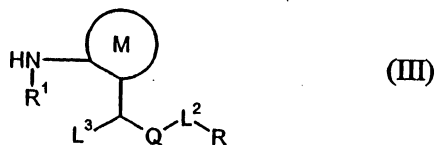


其中

A 如上述定義,

$X^1$  代表鹵素或羥基,

與式(III)苯胺衍生物反應取得



其中

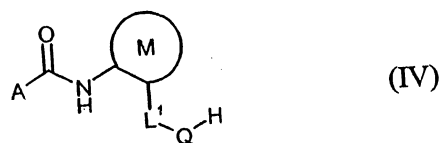
$R^1$ 、M、Q、 $L^2$  與 R 如上述定義,

$L^3$  代表氫或  $C_1$ - $C_9$  烷基,

可能於觸媒之存在下, 可能於縮合劑之存在下, 可能於  
酸結合劑之存在下, 及可能於稀釋劑之存在下進行,

或

(b) 式(IV)羧醯胺



其中 M、L<sup>1</sup>、Q 與 A 如上述定義，  
與式(V)化合物反應取得



其中

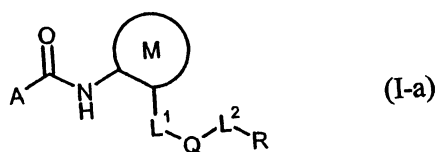
L<sup>2</sup> 與 R 如上述定義，

Y 代表鹵素、三氟甲基磺醯基、甲基磺醯基或 4-甲苯  
基磺醯基，

其係於鹼之存在下及於稀釋介質之存在下進行，

或

(c) 式(I-a)羧醯胺



其中 M、L<sup>1</sup>、Q、L<sup>2</sup>、R 與 A 如上述定義，  
與式(VI)鹵化物反應取得



其中

X<sup>2</sup> 代表氯、溴或碘，

$R^{1-A}$  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； $C_1-C_6$  鹵烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷硫基、 $C_1-C_4$  鹵烷基-亞磺醯基、 $C_1-C_4$  鹵烷基磺醯基、鹵- $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_3-C_8$  鹵環烷基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子；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；鹵-( $C_1-C_3$ -烷基)羰基- $C_1-C_3$ -烷基、鹵-( $C_1-C_3$ -烷氧基)羰基- $C_1-C_3$ -烷基，其分別含有 1 至 13 個氟、氯與/或溴原子；

( $C_1-C_8$ -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；( $C_1-C_6$ -鹵烷基)羰基、( $C_1-C_6$ -鹵烷氧基)羰基、(鹵- $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基)羰基、( $C_3-C_8$ -鹵環烷基)羰基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子；或  $-C(=O)C(=O)R^2$ 、 $-CONR^3R^4$  或  $-CH_2NR^5R^6$ ，

其中  $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  與  $R^6$  如上述定義，

其係於鹼之存在下及於稀釋介質之存在下進行。

最後，已發現新穎之式(I)羧醯胺具有極佳抗微生物性質，且可用於對抗不要之微生物，供保護植物及保護原料。

本發明化合物可呈多種不同異構型之混合物，特定言之立體異構物之混合物，如，例如：E-與 Z-、蘇型-與赤型，及光學異構物，及若適當時，亦包括互變異構物。本發明包括 E 與 Z 型，及蘇型-與赤型，及光學異構物，此等異構物之任何混合物及可能之互變異構物。

式(I)提供根據本發明羧醯胺之一般定義。上文及下文中所  
 示化學式之較佳基團定義如下。此等定義亦適用於式(I)  
 之終產物及所有中間物。

R<sup>1</sup> 較佳為代表氫、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基亞磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-  
 5 烷磺醯基、C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基；  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基亞磺醯  
 基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基磺醯基、鹵-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷  
 基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>-鹵環烷基，其分別具有 1 至 9 個氟、氯與/  
 或溴原子；甲醯基、甲醯基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基)  
 10 羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷氧基)羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基；鹵  
 -(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基)羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基、鹵-(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷氧基)羰基  
 -C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基，其分別具有 1 至 13 個氟、氯與/或溴原子；  
 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-烷基)羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基)羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷氧基  
 -C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷基)羰基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-環烷基)羰基；(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基)  
 15 羰基、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷氧基)羰基、(鹵-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-  
 烷基)羰基、(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-鹵環烷基)羰基，其分別具有 1 至 9  
 個氟、氯與/或溴原子；或-C(=O)C(=O)R<sup>2</sup>、-CONR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>  
 或-CH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>。

R<sup>1</sup> 特別佳為代表氫、甲基、乙基、正或異丙基、正、異、  
 20 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、三氟甲磺醯基、三氟甲氧基甲基；甲醯基、  
 $-\text{CH}_2-\text{CHO}$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CHO}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、  
 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}-\text{CH}_3$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、  
 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、  
 $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CH}_3$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、  
 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CCl}_3$ 、  
 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CCl}_3$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、  
 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CCl}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、  
 $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CF}_3$ 、  
 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CCl}_3$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CO}_2\text{CCl}_2\text{CCl}_3$ ；  
 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  
 $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{R}^2$ 、 $-\text{CONR}^3\text{R}^4$  或  $-\text{CH}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ 。

$\text{R}^1$  最特別佳為代表氫、甲基、甲氧基甲基、甲醯基、  
 $-\text{CH}_2-\text{CHO}$ 、 $-(\text{CH}_2)_2-\text{CHO}$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_3$ 、  
 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{CH}_2-\text{CO}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{CHO}$ 、  
 $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{CH}_2\text{OCH}_3$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_3$ 、  
 $-\text{C}(=\text{O})\text{CO}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ 。

$\text{R}^2$  較佳為代表氫、 $\text{C}_1-\text{C}_6$  烷基、 $\text{C}_1-\text{C}_4$  烷氧基、 $\text{C}_1-\text{C}_3$ -烷氧基- $\text{C}_1-\text{C}_3$ -烷基、 $\text{C}_3-\text{C}_6$  環烷基； $\text{C}_1-\text{C}_4$  鹵烷基、 $\text{C}_1-\text{C}_4$  鹵烷氧基、鹵- $\text{C}_1-\text{C}_3$ -烷氧基- $\text{C}_1-\text{C}_3$ -烷基、 $\text{C}_3-\text{C}_6$  鹵環烷基，

其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子。

$R^2$  特別佳為代表氫、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  $R^3$  與  $R^4$  較佳為分別獨立代表氫、 $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_1$ - $C_4$ -烷氧基- $C_1$ - $C_4$ -烷基、 $C_3$ - $C_6$  環烷基； $C_1$ - $C_4$  鹵烷基、鹵- $C_1$ - $C_3$  烷氧基- $C_1$ - $C_3$ -烷基、 $C_3$ - $C_6$  鹵環烷基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子。

10  $R^3$  與  $R^4$  較佳為亦可與其所附接之氮原子共同代表具有 5 或 6 個環原子之飽和之經取代之雜環，其可經鹵素或  $C_1$ - $C_4$ -烷基之相同或相異取代基單取代至四取代，其中該雜環可另包含 1 或 2 個由氧、硫或  $NR^7$  構成之不相鄰雜原子。

15  $R^3$  與  $R^4$  特別佳為分別獨立代表氫、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  $R^3$  與  $R^4$  特別佳為亦可與其所附接之氮原子共同形成經取代之不飽和雜環，其較佳為經選自由氟、氯、溴或甲基所組成群中之相同或相異取代基單取代至四取代，該雜環為嗎啉、硫嗎啉或六氫吡啶，其中六氫吡啶之第二氮原子可經  $R^7$  取代。

$R^5$  與  $R^6$  較佳為分別獨立代表氫、 $C_1$ - $C_6$ -烷基、 $C_3$ - $C_6$ -環烷基； $C_1$ - $C_4$ -鹵烷基、 $C_3$ - $C_6$ -鹵環烷基，其分別具有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子。

$R^5$  與  $R^6$  較佳為亦可與其所附接之氮原子共同代表具有 5 或 6 個環原子之飽和之經取代之雜環，其可經鹵素或  $C_1$ - $C_4$ -烷基之相同或相異取代基單取代至四取代，其中該雜環可另包含 1 或 2 個由氧、硫或  $NR^7$  構成之不相鄰雜原子。

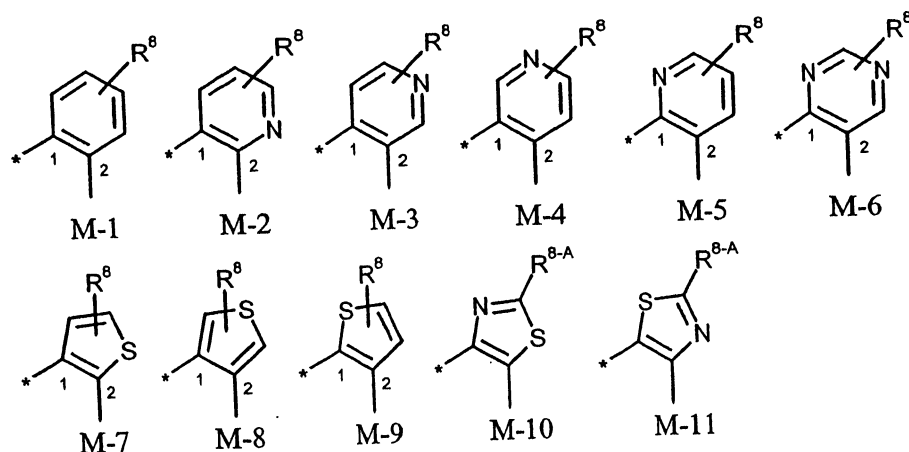
$R^5$  與  $R^6$  特別佳為分別獨立代表氫、甲基、乙基、正-或異丙基、正、異-、第二-或第三-丁基、甲氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基甲基、乙氧基乙基、環丙基、環戊基、環己基；三氟甲基、三氯甲基、三氟乙基、三氟甲氧基甲基。

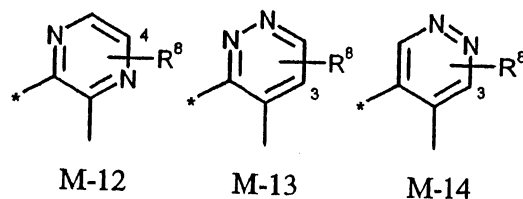
$R^5$  與  $R^6$  特別佳為亦可與其所附接之氮原子共同形成經取代之不飽和雜環，其較佳為經選自：氟、氯、溴或甲基所組成群中之相同或相異取代基單取代至四取代，該雜環為嗎啉、硫嗎啉或六氫吡啶，其中六氫吡啶之第二氮原子可經  $R^7$  取代。

$R^7$  較佳為代表氫或  $C_1$ - $C_4$  烷基。

$R^7$  特別佳為代表氫、甲基、乙基、正-或異丙基、正-、異-、第二-或第三丁基。

M 較佳為代表下列一種環：





其中以星號表示之鍵結係與醯胺鍵結。

M 特別佳為代表選自：M-1、M-2、M-3、M-6、M-7、M-10  
或 M-11 中之環。

M 亦特別佳為代表選自：M-1、M-2、M-3、M-4、M-5、  
M-6 或 M-10、M-11 之環。

M 最特別佳為代表環 M-1。

M 亦最特別佳為代表雜環 M-2。

M 亦最特別佳為代表雜環 M-3。

M 亦最特別佳為代表雜環 M-6。

M 亦最特別佳為代表雜環 M-7。

M 亦最特別佳為代表雜環 M-10。

M 亦最特別佳為代表雜環 M-11。

R<sup>8</sup> 較佳為代表氫。

R<sup>8</sup> 當 M 代表 M1 時，其亦較佳為代表氟，該氟特別佳為  
位於 4-、5-或 6-位置與最特別佳為 4-或 6-位置，尤其  
佳為 4-位置。

R<sup>8</sup> 當 M 代表 M1 時，其亦較佳為代表氯，其中氯特別佳  
為位於 4-或 6-位置。

R<sup>8</sup> 當 M 代表 M1 時，其亦較佳為代表甲基，其中甲基特  
別佳為位於 3-位置，亦特別佳為位於 4-位置。

R<sup>8</sup> 當 M 代表 M1 時，其亦較佳為代表甲氧基，其中甲氧

基特別佳為位於 4-位置。

R<sup>8</sup> 當 M 代表 M1 時，其亦較佳為代表三氟甲基，其中三氟甲基特別佳為位於 4-或 6-位置。

5 R<sup>8</sup> 當 M 代表 M-2、M-3、M-4 或 M-5 時，亦較佳為代表氟，其中氟特別佳為位於 6-位置(M-2、M-3)或 3-位置(M-4、M-5)。

R<sup>8</sup> 當 M 代表 M-2、M-3、M-4 或 M-5 時，其亦較佳為代表氯，其中氯特別佳為位於 6-位置(M-2、M-3)或 3-位置(M-4、M-5)。

10 R<sup>8</sup> 當 M 代表 M-2、M-3、M-4 或 M-5 時，其亦較佳為代表甲基，其中甲基特別佳為位於 4-位置(M-2)或 3-位置(M-3、M-4、M-5)。

R<sup>8</sup> 當 M 代表 M-6 時，其亦較佳為代表甲基，其中甲基特別佳為位於 3-位置。

15 R<sup>8</sup> 當 M 代表 M-6 時，其亦較佳為代表三氟甲基，其中三氟甲基特別佳為位於 3-位置。

R<sup>8</sup> 當 M 代表 M-7、M-8 或 M-9 時，其亦較佳為代表氯，其中氯特別佳為位於 5-位置(M-7、M-8)或 3-位置 (M-9)。

20 R<sup>8</sup> 當 M 代表 M-7、M-8 或 M-9 時，其亦較佳為代表甲基，其中甲基特別佳為位於 5-位置 (M-7、M-8)或 3-位置(M-9)。

R<sup>8</sup> 當 M 代表 M-12 時，其亦較佳為代表甲基，其中甲基特別佳為位於 4-位置。

R<sup>8</sup> 當 M 代表 M-12 時，其亦較佳為代表三氟甲基，其中三氟甲基特別佳為位於 4-位置。

$R^8$  當 M 代表 M-13 時，其亦較佳為代表甲基，其中甲基特別佳為位於 3-位置。

$R^8$  當 M 代表 M-13 時，其亦較佳為代表三氟甲基，其中三氟甲基特別佳為位於 3-位置。

5  $R^8$  當 M 代表 M-14 時，其亦較佳為代表甲基，其中甲基特別佳為位於 3-位置。

$R^8$  當 M 代表 M-14 時，其亦較佳為代表三氟甲基，其中三氟甲基特別佳為位於 3-位置。

$R^{8-A}$  較佳為代表氫。

10  $R^{8-A}$  亦較佳為代表甲基。

$R^{8-A}$  亦較佳為代表三氟甲基。

$L^1$  較佳為代表  $C_1-C_6$  伸烷基(烷二基)。

$L^1$  特別佳為代表  $-CH_2-$ 、 $-CH(CH_3)-$  或  $-(CH_2)_2C(CH_3)_2-$ 。

$L^1$  亦特別佳為代表  $-(CH_2)-$ 。

15 Q 較佳為代表 O。

Q 亦較佳為代表 S。

Q 亦較佳為代表 SO。

Q 亦較佳為代表  $SO_2$ 。

Q 亦較佳為代表  $NR^9$ ，特別佳為 NH。

20  $L^2$  較佳為代表一直接鏈結。

$L^2$  亦較佳為代表  $SiR^{10}R^{11}$ 。

$L^2$  亦較佳為代表 CO。

R 較佳為代表氫、 $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_3$ -烷氧基  
- $C_1-C_3$ -烷基、 $C_1-C_3$ -烷硫基- $C_1-C_3$ -烷基或  $C_3-C_6$  環烷基。

R 亦較佳為代表  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基。

R 特別佳為代表氫、甲基、乙基、正-或異丙基、正-、第二-、異-或第三丁基、甲氧基、乙氧基、正-或異丙氧基、正-、第二-、異-或第三丁氧基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、甲硫基甲基、乙硫基甲基、甲硫基乙基、乙硫基乙基或環丙基。

R 亦特別佳為代表 1-甲基丁基、包含 1 至 5 個氟、氯或溴原子之  $C_1$ - $C_2$ -鹵烷基、環戊基或環己基。

R 最特別佳為代表氫、甲基、乙基、正-或異丙基、異或第三丁基、甲氧基、異丙氧基、異-或第三丁氧基、甲氧基甲基或甲硫基甲基。

R 亦最特別佳為代表第二丁基、1-甲基丁基、二氯甲基、環丙基、環戊基或環己基。

R 尤其佳為代表氫、甲基、乙基、正-或異丙基、異-或第三丁基、甲氧基、異丙氧基、異-或第三丁氧基。

R 亦尤其佳為代表第二丁基或 1-甲基丁基。

R<sup>9</sup> 較佳為代表氫、 $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_1$ - $C_3$ -烷氧基- $C_1$ - $C_3$ -烷基、 $C_1$ - $C_3$ -烷硫基- $C_1$ - $C_3$ -烷基或  $C_3$ - $C_6$  環烷基。

R<sup>9</sup> 特別佳為代表氫、甲基、乙基、正-或異丙基、正-、第二-、異-或第三丁基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、甲硫基甲基、乙硫基甲基、甲硫基乙基、乙硫基乙基或環丙基。

R<sup>9</sup> 最特別佳為代表氫、甲基、乙基、正-或異丙基、異-或第三丁基、甲氧基甲基或甲硫基甲基。

$R^9$  尤其佳為代表氫或甲基。

$R^{10}$  與  $R^{11}$  較佳為分別獨立代表  $C_1-C_6$  烷基、 $C_1-C_6$  烷氧基、 $C_1-C_3$ -烷氧基- $C_1-C_3$ -烷基或  $C_1-C_3$ -烷硫基- $C_1-C_3$ -烷基。

$R^{10}$  與  $R^{11}$  特別佳為分別獨立代表甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、甲氧基甲基、乙氧基甲基、甲氧基乙基、乙氧基乙基、甲硫基甲基、乙硫基甲基、甲硫基乙基或乙硫基乙基。

$R^{10}$  與  $R^{11}$  最特別佳為分別獨立代表甲基、甲氧基、甲氧基甲基或甲硫基甲基。

$R^{10}$  與  $R^{11}$  尤其佳為分別獨立代表甲基。

A 較佳為代表 A1、A2、A3、A4、A5、A6、A9、A10、A11、A12、A17 或 A18 基團中之一。

A 特別佳為代表 A1、A2、A4、A5、A6、A9、A11、A16、A17、A18 基團中之一。

A 最特別佳為代表 A1 基團。

A 亦最特別佳為代表 A2 基團。

A 亦最特別佳為代表 A4 基團。

A 亦最特別佳為代表 A5 基團。

A 亦最特別佳為代表 A6 基團。

A 亦最特別佳為代表 A9 基團。

A 亦最特別佳為代表 A11 基團。

A 亦最特別佳為代表 A16 基團。

A 亦最特別佳為代表 A18 基團。

$R^{12}$  較佳為代表氫、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、

C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子)、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<sup>12</sup> 特別佳為代表氫、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。

R<sup>12</sup> 最特別佳為代表氫、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。

R<sup>12</sup> 尤其佳為代表甲基、二氟甲基、三氟甲基或 1-氟乙基。

R<sup>13</sup> 較佳為代表氫、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基、甲氧基、乙氧基、甲硫基或乙硫基。

R<sup>13</sup> 特別佳為代表氫、氟、氯、溴、碘或甲基。

R<sup>13</sup> 最特別佳為代表氫、氟、氯或甲基。

R<sup>14</sup> 較佳為代表氫、甲基、乙基、正丙基、異丙基、包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基、羥基甲基、羥基乙基、環丙基、環戊基、環己基或苯基。

R<sup>14</sup> 特別佳為代表氫、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。

R<sup>14</sup> 最特別佳為代表氫、甲基、三氟甲基或苯基。

R<sup>14</sup> 尤其佳為代表甲基。

R<sup>15</sup> 與 R<sup>16</sup> 較佳為分別獨立代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙

基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1-C_2$  鹵烷基。

$R^{15}$  與  $R^{16}$  特別佳 為分別獨立代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、二氟氯甲基或三氟甲基。

$R^{15}$  與  $R^{16}$  最特別佳 為分別獨立代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基或三氟甲基。

$R^{15}$  與  $R^{16}$  尤其佳 為分別獨立代表氫。

$R^{17}$  較佳 為代表氟、氯、溴、氟基、甲基、乙基、 $C_1-C_2$  鹵烷基或  $C_1-C_2$  鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子)。

$R^{17}$  特別佳 為代表氟、氯、溴、氟基、甲基、三氟甲基、三氟甲氧基、二氟甲氧基、二氟氯甲氧基或三氟甲氧基。

$R^{17}$  最特別佳 為代表氟、氯、溴、碘、甲基、三氟甲基或三氟甲氧基。

$R^{17}$  尤其佳 為代表甲基。

$R^{18}$  與  $R^{19}$  較佳 為分別獨立代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1-C_2$  鹵烷基。

$R^{18}$  與  $R^{19}$  特別佳 為分別獨立代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基、二氟氯甲基或三氟甲基。

$R^{18}$  與  $R^{19}$  最特別佳 為分別獨立代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基、二氟甲基、三氟甲基或三氟甲基。

$R^{18}$  與  $R^{19}$  尤其佳 為分別獨立代表氫。

$R^{20}$  較佳 為代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1-C_2$  鹵烷基。

$R^{20}$  特別佳 為代表氫、氟、氯、溴、碘、甲基或三氟甲基。

R<sup>20</sup> 最特別佳為代表甲基。

R<sup>21</sup> 較佳為代表氫、氟、氯、溴、碘、羥基、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷氧基或 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷硫基 (其分別含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子)。

5 R<sup>21</sup> 特別佳為代表氫、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  
10 三氯甲硫基。

R<sup>21</sup> 最特別佳為代表氫、氟、氯、溴、碘、甲基、二氟甲基、三氟甲基或三氯甲基。

R<sup>21</sup> 尤其佳為代表碘、甲基、二氟甲基或三氟甲基。

15 R<sup>22</sup> 較佳為代表氟、氯、溴、碘、羥基、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、二氟甲硫基、三氟甲硫基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子)。

20 R<sup>22</sup> 特別佳為代表氟、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。

R<sup>22</sup> 最特別佳為代表氟、氯、溴、碘、甲基、三氟甲基、二

氟甲基或三氟甲基。

5  $R^{23}$  較佳為代表氫、氟、氯、溴、碘、氰基、 $C_1-C_4$  烷基、  
甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、 $C_1-C_2$  鹵烷基或  $C_1-C_2$   
鹵烷氧基(其分別包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子)、  
 $C_1-C_2$  烷基亞磺醯基或  $C_1-C_2$  烷基磺醯基。

$R^{23}$  特別佳為代表氫、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、三氟甲基、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、三氟甲氧基、甲基亞磺醯基或甲基磺醯基。

$R^{23}$  最特別佳為代表氫、氟、氯、溴、碘、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、三氟甲基、甲基亞磺醯基或甲基磺醯基。

$R^{23}$  尤其佳為代表氫。

15  $R^{24}$  較佳為代表甲基、乙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴  
原子之  $C_1-C_2$  鹵烷基。

$R^{24}$  特別佳為代表甲基、乙基、三氟甲基、二氟甲基、二氟  
氯甲基或三氟甲基。

$R^{25}$  較佳為代表甲基或乙基。

20  $R^{25}$  特別佳為代表甲基。

$Q^1$  較佳為代表 S (硫)、 $SO_2$  或  $CH_2$ 。

$Q^1$  特別佳為代表 S (硫)或  $CH_2$ 。

$Q^1$  最特別佳為代表 S (硫)。

p 較佳為代表 0 或 1。

p 特別佳為代表 0。

R<sup>26</sup> 較佳為代表甲基、乙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基。

R<sup>26</sup> 特別佳為代表甲基、乙基、三氟甲基、二氟甲基、二氯  
5 氯甲基或三氯甲基。

R<sup>26</sup> 最特別佳為代表甲基、三氟甲基、二氟甲基或三氯甲基。

R<sup>27</sup> 較佳為代表甲基、乙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴  
10 原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基。

R<sup>27</sup> 特別佳為代表甲基、乙基、三氟甲基、二氟甲基、二氯  
10 氯甲基或三氯甲基。

R<sup>27</sup> 最特別佳為代表甲基、三氟甲基、二氟甲基或三氯甲基。

R<sup>28</sup> 與 R<sup>29</sup> 較佳為分別獨立代表氫、氟、氯、溴、胺基、甲基、  
乙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基。

R<sup>28</sup> 與 R<sup>29</sup> 特別佳為分別獨立代表氫、氟、氯、溴、甲基、  
15 乙基、三氟甲基、二氟甲基、二氯氯甲基或三氯甲基。

R<sup>28</sup> 與 R<sup>29</sup> 最特別佳為分別獨立代表氫、氟、氯、溴、甲基、  
三氯甲基、二氯甲基或三氯甲基。

R<sup>28</sup> 與 R<sup>2</sup> 尤其佳為分別獨立代表氫。

R<sup>30</sup> 較佳為代表氫、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基或包含 1  
20 至 5 個氟、氯與/或溴原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基。

R<sup>30</sup> 特別佳為代表氫、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基、三氟  
甲基、二氯甲基、二氯氯甲基或三氯甲基。

R<sup>30</sup> 最特別佳為代表氫、氟、氯、溴、碘、甲基、三氟甲基、  
二氯甲基或三氯甲基。

$R^{30}$  尤其佳為代表甲基。

$R^{31}$  與  $R^{32}$  較佳為分別獨立代表氫、氟、氯、溴、胺基、硝基、甲基、乙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1-C_2$  鹵烷基。

5  $R^{31}$  與  $R^{32}$  特別佳為分別獨立代表氫、氟、氯、溴、硝基、甲基、乙基、三氟甲基、二氟甲基、二氟氯甲基或三氯甲基。

$R^{31}$  與  $R^{32}$  最特別佳為分別獨立代表氫、氟、氯、溴、甲基、三氯甲基、二氯甲基或三氯甲基。

$R^{31}$  與  $R^{32}$  尤其佳為分別獨立代表氫。

10  $R^{33}$  較佳為代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1-C_2$  鹵烷基。

$R^{33}$  特別佳為代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基、三氯甲基、二氯甲基、二氟氯甲基或三氯甲基。

15  $R^{33}$  最特別佳為代表氫、氟、氯、溴、甲基、三氯甲基、二氯甲基或三氯甲基。

$R^{33}$  尤其佳為代表甲基。

$R^{34}$  較佳為代表氫、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、乙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1-C_2$  鹵烷基。

20  $R^{34}$  特別佳為代表氫、氟、氯、溴、胺基、甲基胺基、二甲基胺基、氰基、甲基、乙基、三氯甲基、二氯甲基、二氟氯甲基或三氯甲基。

$R^{34}$  最特別佳為代表氫、氟、氯、溴、胺基、甲基胺基、二甲基胺基、甲基、三氯甲基、二氯甲基或三氯甲基。

R<sup>34</sup> 尤其佳為代表胺基、甲基胺基、二甲基胺基、甲基或三氟甲基。

R<sup>35</sup> 較佳為代表氟、氯、溴、甲基、乙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基。

5 R<sup>35</sup> 特別佳為代表氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、二氟甲基、二氟氯甲基或三氯甲基。

R<sup>35</sup> 最特別佳為代表氟、氯、溴、甲基、三氟甲基、二氟甲基或三氯甲基。

R<sup>35</sup> 尤其佳為代表甲基、三氟甲基或二氟甲基。

10 R<sup>36</sup> 較佳為代表氫、氟、氯、溴、胺基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基胺基、二(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基)胺基、氰基、甲基、乙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基。

15 R<sup>36</sup> 特別佳為代表氫、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。

R<sup>36</sup> 最特別佳為代表氫、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。

R<sup>36</sup> 尤其佳為代表胺基、甲基胺基、二甲基胺基、甲基或三氟甲基。

20 R<sup>37</sup> 較佳為代表氟、氯、溴、甲基、乙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基。

R<sup>37</sup> 特別佳為代表氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、二氟甲基、二氟氯甲基或三氯甲基。

R<sup>37</sup> 最特別佳為代表氟、氯、溴、甲基、三氟甲基、二氟甲

基或三氟甲基。

R<sup>37</sup> 尤其佳為代表甲基、三氟甲基或二氟甲基。

R<sup>38</sup> 較佳為代表氟、氯、溴、甲基、乙基或包含 1 至 5 個氟、  
氯與/或溴原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基。

5 R<sup>38</sup> 特別佳為代表氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、二  
氟甲基、二氟氯甲基或三氟甲基。

R<sup>38</sup> 最特別佳為代表氟、氯、溴、甲基、三氟甲基、二氟甲  
基或三氟甲基。

R<sup>39</sup> 較佳為代表氫、甲基或乙基。

10 R<sup>39</sup> 特別佳為代表甲基。

R<sup>40</sup> 較佳為代表氟、氯、溴、甲基或乙基。

R<sup>40</sup> 特別佳為代表氟、氯或甲基。

R<sup>41</sup> 較佳為代表甲基、乙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴  
原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基。

15 R<sup>41</sup> 特別佳為代表甲基、乙基、三氟甲基、二氟甲基、二氟  
氯甲基或三氟甲基。

R<sup>41</sup> 最特別佳為代表甲基、三氟甲基、二氟甲基或三氟甲基。

R<sup>41</sup> 尤其佳為代表甲基或三氟甲基。

20 R<sup>42</sup> 較佳為代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基或包含 1 至 5  
個氟、氯與/或溴原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基。

R<sup>42</sup> 特別佳為代表氫、氟、氯、溴、甲基或三氟甲基。

R<sup>43</sup> 較佳為代表氟、氯、溴、碘、羥基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、甲氧  
基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、二氟甲硫基、三氟甲硫  
基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5

個氟、氯與/或溴原子)。

R<sup>43</sup> 特別佳為代表氟、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。

5 R<sup>43</sup> 最特別佳為代表氟、氯、溴、碘、甲基、三氟甲基、二氟甲基或三氯甲基。

R<sup>44</sup> 較佳為代表氫、甲基、乙基、包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、羥基甲基、羥基乙基、甲基磺醯基或二甲基胺基磺醯基。

10 R<sup>44</sup> 特別佳為代表氫、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。

R<sup>44</sup> 最特別佳為代表甲基或甲氧基甲基。

R<sup>45</sup> 較佳為代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基。

15 R<sup>45</sup> 特別佳為代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基、三氟甲基、二氟甲基或三氯甲基。

R<sup>45</sup> 最特別佳為代表氫或甲基。

R<sup>46</sup> 較佳為代表氫、氟、氯、溴、碘、氰基、甲基、乙基、異丙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基。

20 R<sup>46</sup> 特別佳為代表氫、氟、氯、溴、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<sup>46</sup> 最特別佳為代表氫、甲基、二氟甲基或三氯甲基。

R<sup>47</sup> 較佳為代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基或包含 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 鹵烷基。

$R^{47}$  特別佳為代表氫、氟、氯、溴、碘、甲基或三氟甲基。

$R^{47}$  最特別佳為代表氫。

$R^{48}$  較佳為代表甲基、乙基、正丙基或異丙基。

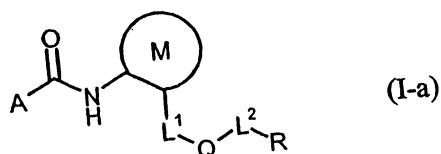
$R^{48}$  特別佳為代表甲基或乙基。

5           較佳具體實施例為彼等相應之式(I)化合物，其中所有基團均分別如上述較佳定義。

特別佳具體實施例為彼等相應之式(I)化合物，其中所有基團均分別如上述特別佳之定義。

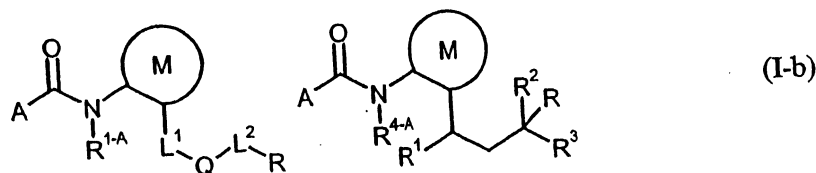
10           下列幾組新穎羧醯胺類為較佳者，分別視為如上述之相應式(I)化合物之亞群：

第 1 組：式(I-a)羧醯胺



15           其中  $M$ 、 $L^1$ 、 $Q$ 、 $L^2$ 、 $R$  與  $A$  如上述定義。

第 2 組：式(I-b)羧醯胺



20           其中  $R^{1-A}$ 、 $M$ 、 $L^1$ 、 $Q$ 、 $L^2$ 、 $R$  與  $A$  如上述定義。

$R^{1-A}$  較佳為代表  $C_1$ - $C_6$  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；  
 $C_1$ - $C_4$  鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷硫基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷基亞磺醯基、

$C_1-C_4$  鹵烷基磺醯基、鹵- $C_1-C_3$ -烷氧基- $C_1-C_3$ -烷基、  
 $C_3-C_8$  鹵環烷基(其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原  
 子)；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；鹵  
 5 -( $C_1-C_3$ -烷基)羰基- $C_1-C_3$ -烷基、鹵-( $C_1-C_3$ -烷氧基)羰基  
 - $C_1-C_3$ -烷基(其分別含有 1 至 13 個氟、氯與/或溴原子)；  
 ( $C_1-C_6$  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；( $C_1-C_4$  鹵烷基)  
 羰基、( $C_1-C_4$  鹵烷氧基)羰基、(鹵- $C_1-C_3$ -烷氧基- $C_1-C_3$ -  
 10 烷基)羰基、( $C_3-C_6$  鹵環烷基)羰基(其分別具有 1 至 9  
 個氟、氯與/或溴原子)；或  $-C(=O)C(=O)R^2$ 、 $-CONR^3R^4$   
 或  $-CH_2NR^5R^6$ 。

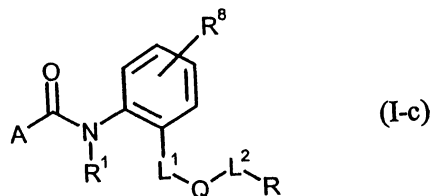
$R^{1-A}$  特別佳為代表甲基、乙基、正或異丙基、正、異、第  
 二-或第三-丁基、戊基或己基、甲基亞磺醯基、乙基亞  
 15 磺醯基、正或異丙基亞磺醯基、正-、異-、第二-或第  
 三-丁基亞磺醯基、甲磺醯基、乙基磺醯基、正或異丙  
 基磺醯基、正-、異-、第二-或第三-丁磺醯基、甲氧基  
 甲基、甲氧基乙基、乙氧基甲基、乙氧基乙基、環丙  
 基、環戊基、環己基、三氟甲基、三氯甲基、三氟乙  
 20 基、二氟甲硫基、二氟氯甲硫基、三氟甲硫基、三氟  
 甲基亞磺醯基、三氟甲磺醯基、三氟甲氧基甲基；甲  
 醯基、 $-CH_2-CHO$ 、 $-(CH_2)_2-CHO$ 、 $-CH_2-CO-CH_3$ 、  
 $-CH_2-CO-CH_2CH_3$ 、 $-CH_2-CO-CH(CH_3)_2$ 、 $-(CH_2)_2-CO-CH_3$ 、  
 $-(CH_2)_2-CO-CH_2CH_3$ 、 $-(CH_2)_2-CO-CH(CH_3)_2$ 、 $-CH_2-CO_2CH_3$ 、

-CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>-CO-CF<sub>3</sub>、  
 -CH<sub>2</sub>-CO-CCl<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>、  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、  
 -CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CCl<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>、  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>、  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CO<sub>2</sub>CCl<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>；

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<sup>2</sup>、-CONR<sup>3</sup>R<sup>4</sup>或-CH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>。

R<sup>1-A</sup> 最特別佳為代表甲基、甲氧基甲基、甲醯基、-CH<sub>2</sub>-CHO、  
 -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-CHO、-CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>-CO-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、  
 -CH<sub>2</sub>-CO-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-C(=O)CHO、-C(=O)C(=O)CH<sub>3</sub>、  
 -C(=O)C(=O)CH<sub>2</sub>OCH<sub>3</sub>、-C(=O)CO<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-C(=O)CO<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>。

第 3 組：式(I-c)羧醯胺



其中 R<sup>1</sup>、R<sup>8</sup>、L<sup>1</sup>、Q、L<sup>2</sup>、R 與 A 如上述定義。

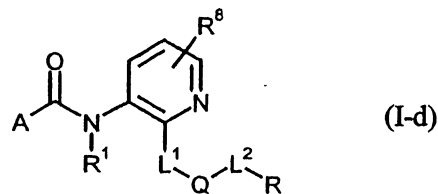
式(I-c)羧醯胺之較佳具體實施例為其中 R<sup>1</sup> 代表氫。

式(I-c)羧醯胺之較佳具體實施例為其中 R<sup>8</sup> 代表氫。

式(I-c)羧醯胺之較佳具體實施例為其中 R<sup>1</sup> 與 R<sup>8</sup> 分別代表

氫。

第 4 組：式(I-d)羧醯胺



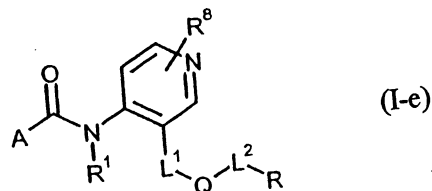
其中  $R^1$ 、 $R^8$ 、 $L^1$ 、 $Q$ 、 $L^2$ 、 $R$  與  $A$  如上述定義。

式(I-d)羧醯胺之較佳具體實施例為其中  $R^1$  代表氫。

式(I-d)羧醯胺之較佳具體實施例為其中  $R^8$  代表氫。

式(I-d)羧醯胺之較佳具體實施例為其中  $R^1$  與  $R^8$  分別代表氫。

第 5 組：式(I-e)羧醯胺



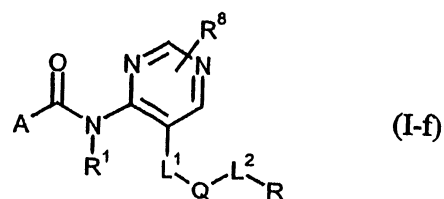
其中  $R^1$ 、 $R^8$ 、 $L^1$ 、 $Q$ 、 $L^2$ 、 $R$  與  $A$  如上述定義。

式(I-e)羧醯胺之較佳具體實施例為其中  $R^1$  代表氫。

式(I-e)羧醯胺之較佳具體實施例為其中  $R^8$  代表氫。

式(I-e)羧醯胺之較佳具體實施例為其中  $R^1$  與  $R^8$  分別代表氫。

第 6 組：式(I-f) 羧醯胺



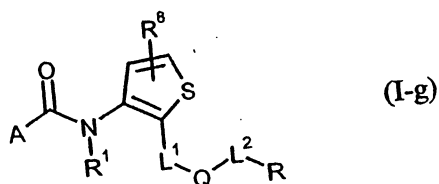
其中  $R^1$ 、 $R^8$ 、 $L^1$ 、 $Q$ 、 $L^2$ 、 $R$  與  $A$  如上述定義。

式(I-f)羧醯胺之較佳具體實施例為其中  $R^1$  代表氫。

式(I-f)羧醯胺之較佳具體實施例為其中  $R^8$  代表氫。

式(I-f)羧醯胺之較佳具體實施例為其中  $R^1$  與  $R^8$  分別代表氫。

#### 第 7 組：式(I-g)羧醯胺



其中  $R^1$ 、 $R^8$ 、 $L^1$ 、 $Q$ 、 $L^2$ 、 $R$  與  $A$  如上述定義。

式(I-g)羧醯胺之較佳具體實施例為其中  $R^1$  代表氫。

式(I-g)羧醯胺之較佳具體實施例為其中  $R^8$  代表氫。

式(I-g)羧醯胺之較佳具體實施例為其中  $R^1$  與  $R^8$  分別代表氫。

其重點為式(I)中  $R^1$  代表氫之化合物(及第 1 至 7 組化合物)。

其重點為式(I)中  $R^1$  代表甲醯基之化合物(及第 1 至 7 組化合物)。

此外，其重點亦為式(I)中  $R^1$  代表  $-C(=O)C(=O)R^2$  之化合物(及第 1 至 7 組化合物)，其中  $R^2$  如上述定義。

飽和或不飽和烴基，如：烷基或烯基，亦可與雜原子組合，如，例如：烷氧基，其可為直鏈或分支。同樣地雙

價烴基，如：伸烷基(烷二基)亦可為直鏈或分支。

可經取代之基團可經單取代或多取代，其中若經多取代時，其取代基可相同或相異。因此，“二烷基胺基”之定義亦包括不對稱取代之胺基，如，例如：甲基乙基胺基。

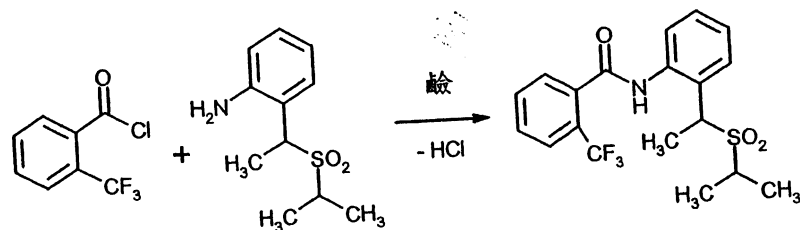
經鹵素取代之基團如，例如：鹵烷基，係經單鹵化或多鹵化。若經多鹵化時，其鹵原子可相同或相異。此時，鹵素代表、氟、氯、溴與碘，特定言之氟、氯與溴。

上述之一般或較佳基團定義及/或說明亦可在其個別範圍與較佳範圍內隨意組合。該等定義亦適用終產物及相應之前體與中間物。尤其當第 1 至 6 組所述及之化合物可能分別指其一般及較佳、特別佳，等等之定義，其中所有較佳定義之組合均有可能。

### 式(I)己基羧基苯胺與中間物之根據本發明製法

#### 製法(a)

若使用 2-三氟甲基苯甲醯氯與{2-[1-(異丙基磺基)乙基]苯基}胺作為起始物時，根據本發明製法(a)可依下列反應圖說明：



式(II)提供進行根據本發明製法(a)時之起始物之羧酸衍生物之一般定義。此式(II)中，A 之較佳、特別佳或最特

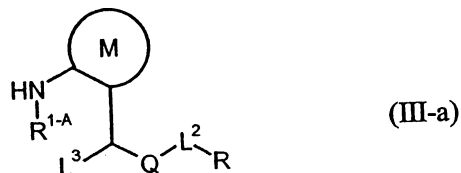
別佳定義均如上述根據本發明式(I)化合物中所分別說明 A 之較佳、特別佳或最特別佳定義。 $X^1$  較佳為代表氯、溴或羥基。

式(II)羧酸衍生物為已知者與/或可依已知製法合成(參見 WO 93/11117、EP-A 0 545 099、EP-A 0589 301 與 EP-A 0589313)。

進行本發明製法(a)所需之另一種起始物苯胺衍生物如式(III)之一般定義。此式(III)中， $R^1$ 、M、Q、 $L^2$  與 R 之較佳、特別佳或最特別佳定義均如上述根據本發明式(I)化合物中所分別說明之較佳、特別佳或最特別佳定義。 $L^3$  較佳為代表氫或  $C_1$ - $C_5$  烷基，特別佳為氫或甲基。

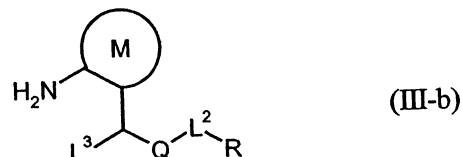
式(III)苯胺衍生物為新穎者。

式(III-a)苯胺衍生物



其中  $R^{1-A}$ 、M、Q、 $L^2$ 、R 與  $L^3$  如上述定義，其製法係由

(d) 式(III-b)苯胺衍生物



其中 M、Q、 $L^2$ 、R 與  $L^3$  如上述定義，與式(VI)鹵化物反應

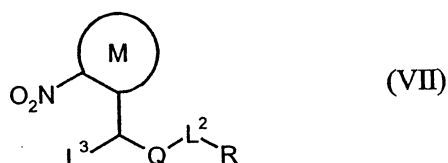


其中  $R^{1-A}$  與  $X^2$  如上述定義，

其係於鹼之存在下及於稀釋介質之存在下進行。

式(III-b)苯胺衍生物製法係由

(e) 式(VII)硝基化合物



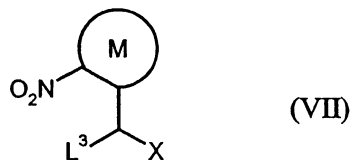
其中 M、Q、 $L^2$ 、R 與  $L^3$  如上述定義，

於金屬與還原劑之存在下，及可能於稀釋劑與可能於另一種反應介質之存在下反應。

進行本發明製法(e)所需之起始物硝基化合物如式(VII)之一般定義。此式(VII)中，M、Q、 $L^2$ 、R 與  $L^3$  之較佳、特別佳或最特別佳定義均如上述根據本發明式(I)或(III)化合物中所分別說明之較佳、特別佳或最特別佳定義。

式(VII)硝基化合物製法為由

(f) 式(VII)硝基化合物



其中

M 與  $L^3$  如上述定義，及

X 代表氯、溴或碘，

與式(IX)化合物反應



其中 Q、 $\text{L}^2$  與 R 如上述定義，

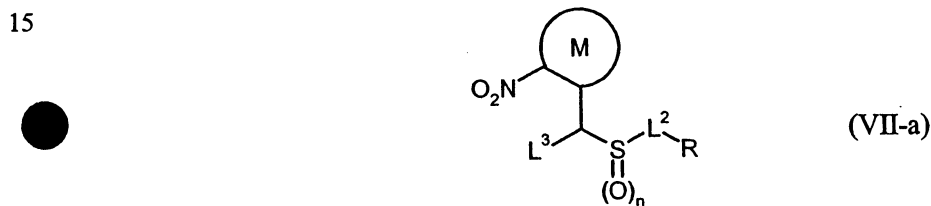
其係於鹼之存在下及可能於稀釋介質之存在下進行。

5 進行本發明製法(f)所需之起始物硝基化合物如式(VII)之一般定義。此式(VII)中，M 與  $\text{L}^3$  之較佳、特別佳或最特別佳定義均如上述根據本發明式(I)或(III)化合物中所分別說明之較佳、特別佳或最特別佳定義。X 較佳為代表氯。

10 進行本發明製法(f)所需之另一種起始物如式(IX)之一般定義。此式(IX)中，Q、 $\text{L}^2$  與 R 之較佳、特別佳或最特別佳定義均如上述根據本發明式(I)或(III)化合物中所分別說明之較佳、特別佳或最特別佳定義。

式(IX)化合物係已知者或可依據已知製法製備。

式(VII-a)硝基化合物之製法



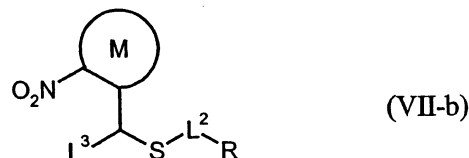
其中

M、 $\text{L}^2$ 、R 與  $\text{L}^3$  如上述定義，及

20 n 代表 1 或 2，

係由

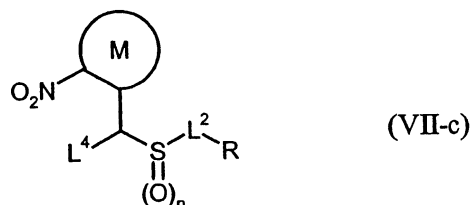
(g) 式(VII-b)硝基化合物



其中  $M$ 、 $L^2$ 、 $R$  與  $L^3$  如上述定義，

於氧化劑之存在下，及可能於稀釋劑之存在下，及可能於另一種反應介質之存在下進行。

式(VII-c)硝基化合物製法

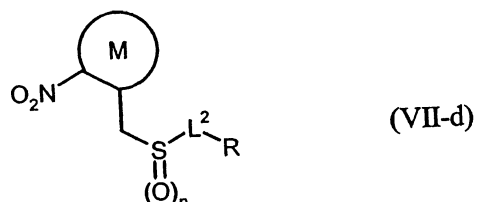


其中

$M$ 、 $L^2$ 、 $R$  與  $n$  如上述定義，及

10  $L^4$  代表  $C_1$ - $C_9$  烷基，較佳為  $C_1$ - $C_5$  烷基，特別佳為甲基，係由

(h) 式(VII-d)硝基化合物



其中  $M$ 、 $L^2$ 、 $R$  與  $n$  如上述定義，

與式(X)鹵化物反應



其中  $L^4$  與  $X^2$  如上述定義，

其係於鹼之存在下及於稀釋介質之存在下進行。

式(X)鹵化物為已知者。

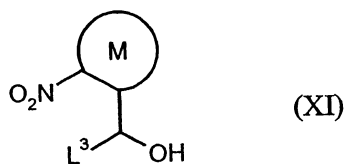
式(VII-a)、(VII-b)、(VII-c)與(VII-d)化合物為式(VII)

硝基化合物之亞群，且包括在此等化合物之一般說明中。

因此其較佳、特別佳，等等定義一樣適用。

式(VII)硝基化合物製法係鹵化

(j) 式(XI)羥基衍生物



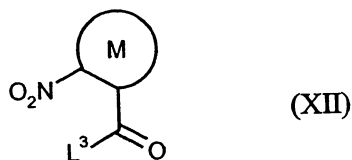
其中 M 與  $L^3$  如上述定義，

其可能於稀釋劑之存在下，可能於酸受體之存在下及可能於觸媒之存在下進行。

進行本發明製法(j)所需之起始物羥基衍生物如式(XI)之一般定義。此式(XI)中，M 與  $L^3$  之較佳、特別佳或最特別佳定義均如上述根據本發明式(I)或(III)化合物中所分別說明之較佳、特別佳或最特別佳定義。

式(XI)羥基衍生物製法係由

(k) 式(XII)醯化芳香族



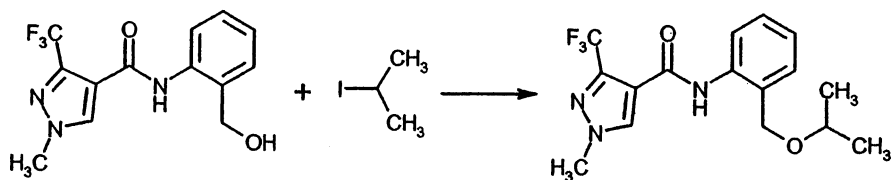
其中 M 與  $L^3$  如上述定義，

於還原劑之存在下及於稀釋劑之存在下，及可能於酸之存在下及可能於觸媒之存在下反應。

式(III)苯胺衍生物亦可類似已知方法製得(參見 EP-A 0 737 682)。

製法(b)

若使用 N-[2-(羥基甲基)苯基]-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-羧醯胺與 2-碘丙烷作為起始物時，則本發明製法(b)可採用下列反應圖說明。

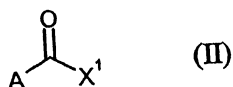


進行本發明製法(b)所需之起始物羧醯胺如式(IV)之一般定義。此式(IV)中，M、L<sup>1</sup>、Q 與 A 之較佳、特別佳或最特別佳定義均如上述根據本發明式(I)中 A 所說明之較佳、特別佳或最特別佳定義。

進行本發明製法(b)所需之起始物亦如式(V)之一般定義。此式(V)中，L<sup>2</sup> 與 R 之較佳、特別佳或最特別佳定義均如上述根據本發明式(I)中 A 所說明之較佳、特別佳或最特別佳定義。Y 較佳為代表氯、溴、碘、三氟甲基磺醯基、甲基磺醯基或 4-甲基苯基磺醯基，特別佳為溴、碘或三氟甲基磺醯基。

式(V)化合物為已知者或可依據已知製法製備。

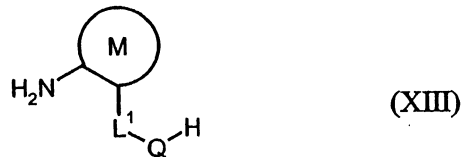
式(IV)羧醯胺為新穎者。其製法係由  
(m)式(II)羧酸衍生物



其中

A 如上述定義，及

$X^1$  代表鹵素或羥基，  
與式(XIII)苯胺衍生物反應



其中

M、 $L^1$  與 Q 如上述定義，

其可能於觸媒之存在下，可能於縮合劑之存在下，及可能於酸結合劑之存在下與可能於稀釋劑之存在下進行。

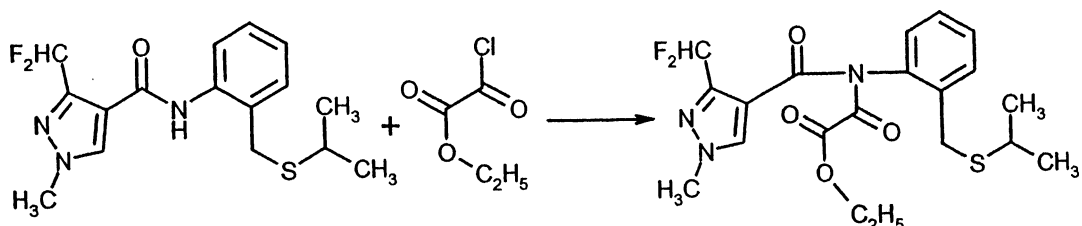
進行本發明製法(m)所需之起始物式(II)羧酸衍生物如本發明製法(a)中之相關說明。

進行本發明製法(m)所需之起始物苯胺衍生物如式(XIII)之一般定義。此式(XIII)中，M、 $L^1$  與 Q 之較佳、特別佳或最特別佳定義均如上述根據本發明式(I)化合物中所說明之較佳、特別佳或最特別佳定義。

式(XIII)苯胺為已知者或可依已知方法製備。

### 製法(c)

若使用 3-(二氟甲基)-N-{2-[(異丙硫基)甲基]苯基}-1-甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺與氯(氧代)乙酸乙酯作為起始物時，則本發明製法(c)可採用下列反應圖說明：



進行本發明製法(c)所需之起始物己基羧基苯胺如式(I-a)之一般定義。此式(I-a)中，M、 $L^1$ 、Q、 $L^2$ 、R 與 A 之較佳、特別佳或最特別佳定義均如上述根據本發明式(I)化合物中所說明之較佳、特別佳或最特別佳定義。

5 式(I-a)己基羧基苯胺同樣為本發明化合物且為本申請案之主題。其可依據本發明製法(a)製得( $R^1 = \text{氫}$ )。

進行本發明製法(c)所需之起始物鹵化物如式(VI)之一般定義。此式(VI)中， $R^{1-A}$ 之較佳、特別佳或最特別佳定義均如上述根據本發明式(I-b)化合物中所分別說明之較佳、  
10 特別佳或最特別佳定義。 $X^2$ 較佳為代表氯或溴。

式(VI)鹵化物係已知者。

## 反應條件

適合進行根據本發明製法(a)與(m)之稀釋劑為所有惰性有機溶劑。此等較佳溶劑包括脂系、脂環系或芳香系烴類，如，例如：石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或萘烷；鹵化烴類，如，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，如：乙醚、二異丙基醚、甲基第三丁基醚、  
15 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，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-甲基吡咯啉酮或六甲基磷酸三醯胺。  
20

根據本發明製法(a)與(m)若適當時，係於合適酸受體之

存在下進行。合適酸受體為所有常用之無機或有機鹼類。此等較佳鹼類包括鹼土金屬或鹼金屬氫化物、氫氧化物、胺化物、醇鹽類、乙酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽，如，例如：氫化鈉、胺化鈉、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鉀、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、碳酸氫鈉或碳酸銨，與三級胺類，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、重氮雙環辛烷(DABCO)、重氮雙環壬烯(DBN)或重氮雙環十一碳烯(DBU)。

根據本發明製法(a)與(m)若適當時，係於合適縮合劑之存在下進行。合適縮合劑為所有此等醯胺化反應常用之縮合劑。可述及例如：酸鹵化物形成劑，如：碳醯氯、三溴化磷、三氯化磷、五氯化磷、磷醯氯、草醯氯或亞硫醯氯；酸酐形成劑，如：氯甲酸乙酯、氯甲酸甲酯、氯甲酸異丙基酯、氯甲酸異丁基酯或甲磺醯氯；碳化二亞胺，如，N,N'-二環己基碳化二亞胺(DCC)，或其他常用之縮合劑，如：五氧化磷、聚磷酸、N,N'-羰基二咪唑、2-乙氧基-1-乙氧基羰基-1,2-二氫喹啉(EEDQ)、三-苯基磷/四氯甲烷或溴化三吡咯啶基磷六氟磷酸鹽。

根據本發明製法(a)與(m)若需要時，係於觸媒之存在下進行。其實例可述及 4-二甲基胺基吡啶、1-羥基苯并三唑或二甲基甲醯胺。

進行根據本發明製法(a)與(m)時，反應溫度可在相當大

範圍內變化。通常，該等製法係於 0°C 至 150°C 之溫度下進行，較佳為 0°C 至 80°C 之溫度。

進行根據本發明製法(a)以合成式(I)化合物時，每莫耳式(II)羧酸衍生物通常使用 0.2 至 5 莫耳，較佳為 0.5 至 2 莫耳式(III)苯胺衍生物。

進行根據本發明製法(m)以合成式(IV)化合物時，每莫耳式(II)羧酸衍生物通常使用 0.2 至 5 莫耳，較佳為 0.5 至 2 莫耳式(XIII)苯胺衍生物。

適合進行根據本發明製法(b)、(c)、(d)與(h)之稀釋劑為所有惰性有機溶劑。較佳溶劑包括脂系、脂環系或芳香系烴類，如，例如：石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或萘烷；鹵化烴類，如，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，如：乙醚、二異丙基醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚，或醯胺類，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-甲基吡咯啉酮或六甲基磷酸三醯胺。

根據本發明製法(b)、(c)、(d)與(h)係於鹼之存在下進行。合適鹼為所有常用之無機或有機鹼類。此等較佳鹼類包括鹼土金屬或鹼金屬氫化物、氫氧化物、胺化物、醇鹽類、乙酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽，如，例如：氫化鈉、胺化鈉、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鉀、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、碳酸氫鈉或碳酸鈉，與三級胺類，  
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  
5 咉、N,N-二甲基胺基吡啶、重氮雙環辛烷(DABCO)、重氮  
雙環壬烯(DBN)或重氮雙環十一碳烯(DBU)。

根據本發明製法(b)、(c)、(d)與(h)之反應溫度可在相當  
大範圍內變化。通常，該製法係於 0°C 至 150°C 之溫度下進  
行，較佳為 20°C 至 110°C 之溫度。

進行根據本發明製法(b)以合成式(I)化合物時，每莫耳  
10 式(IV)羧醯胺通常使用 0.2 至 5 莫耳，較佳為 0.5 至 2 莫耳  
式(V)化合物。

進行根據本發明製法(c)以合成式(I)化合物時，每莫耳  
式(I-a)己基羧基苯胺通常使用 0.2 至 5 莫耳，較佳為 0.5 至  
2 莫耳式(VI)鹵化物。

15 進行根據本發明製法(d)以合成式(III-a)化合物時，每莫  
耳式(III-b)苯胺衍生物通常使用 0.2 至 5 莫耳，較佳為 0.5  
至 2 莫耳式(VI)鹵化物。

進行根據本發明製法(h)以合成式(VII-c)化合物時，每  
莫耳式(VII-d)硝基化合物通常使用 0.2 至 5 莫耳，較佳為  
20 0.5 至 2 莫耳式(X)鹵化物。

適合進行根據本發明製法(e)之稀釋劑為所有惰性有機  
溶劑。較佳溶劑包括脂系、脂環系或芳香系烴類，如，例  
如：石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲  
苯、二甲苯或萘烷；醚類，如：乙醚、二異丙基醚、甲基

第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚，或醯胺類，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-甲基吡咯啉酮或六甲基磷酸三醯胺；亞砷類，如：二甲亞砷；砷類，如：環丁砷；醇類，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、三乙二醇、其與水之混合物或純水。

本發明製法(e)係於金屬之存在下進行。較佳為過渡金屬，如，例如：鈮、鉑、銻、鎳(阮來鎳)、鐵、鈷、鈷、銻、鋅或銻。金屬若必要時可與基質結合，如，例如：碳、樹脂、沸石、鹼金屬或鹼土金屬硫酸鹽。

本發明製法(e)可於還原劑之存在下進行。較適合此製法之材料為元素態氫、甲酸鹽，以鹼金屬甲酸鹽較佳，如，例如：甲酸鈉、及甲酸銨，或金屬氫化物或複合金屬氫化物，如，例如：氫化鋰鋁與氫硼化鈉。

本發明製法(e)可於酸之存在下進行。適合此製法之材料為有機酸類，如，例如：甲酸、乙酸、抗壞血酸，及無機酸，如，例如：鹽酸或硫酸。

本發明製法(e)可於鹼之存在下進行。適合此製法之材料為有機鹼，如，例如：吡啶、及鹼金屬或鹼土金屬氫氧化物之水溶液，如，例如：氫氧化鈉或氫氧化鉀。

進行本發明製法(e)之反應溫度可在相當大範圍內變化。通常，該製法係於-80°C至 300°C之溫度下進行，較佳

為 0°C 至 200°C 之溫度。

使用元素態氫進行本發明製法(e)時，係於氫氣壓 0.5 至 200 巴下，較佳為 1 至 100 巴下進行。

進行根據本發明製法(e)以合成式(III-b)化合物時，每莫耳式(VII)硝基化合物通常使用 0.8 至 1000 莫耳，較佳為 1 至 500 莫耳還原劑(甲酸銨、氫化物，等等)。

適合進行根據本發明製法(f)之稀釋劑為所有惰性有機溶劑。較佳溶劑包括脂系、脂環系或芳香系烴類，如，例如：石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或萘烷；鹵化烴類，如，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，如：乙醚、二異丙基醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚，或醯胺類，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-甲基吡咯啉酮或六甲基磷酸三醯胺。

根據本發明製法(f)係於鹼之存在下進行。合適鹼為所有常用之無機或有機鹼類。此等較佳鹼類包括鹼土金屬或鹼金屬氫化物、氫氧化物、胺化物、醇鹽類、乙酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽，如，例如：氫化鈉、胺化鈉、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鉀、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、碳酸氫鈉或碳酸銨，與三級胺類，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、重氮雙環辛烷(DABCO)、重氮雙環壬烯(DBN)或重氮雙環十一碳烯(DBU)。

根據本發明製法(f)之反應溫度可在相當大範圍內變化。通常，該製法係於 0°C 至 200°C 之溫度下進行，較佳為 20°C 至 150°C 之溫度。

進行根據本發明製法(f)以合成式(VII)化合物時，每莫耳式(VII)硝基化合物通常使用 0.2 至 5 莫耳，較佳為 0.5 至 2 莫耳式(IX)化合物。

適合進行根據本發明製法(g)之稀釋劑為所有惰性有機溶劑。較佳溶劑包括脂系、脂環系或芳香系烴類，如，例如：石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或萘烷；醚類，如：乙醚、二異丙基醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚，或醯胺類，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-甲基吡咯啉酮或六甲基磷酸三醯胺。亞砷類，如二甲亞砷；砷類，如：環丁砷。

根據本發明製法(g)係於氧化劑之存在下進行。所有有機及無機氧化劑均可使用，較佳為元素態氧、臭氧、過氧化物，如，例如：過氧化氫、間氯過苯甲酸、苯甲醯基過氧化物、第三丁基過氧化物；次氯酸鈉；鉻鹽類，如，例如：氧化鉻(VI)、鉻酸、二鉻酸鈉、氯鉻酸吡啶鎘鹽；錳鹽類，如，例如：過錳酸鉀、二氧化錳；二氧化硒；碘酸鹽

類與過碘酸鹽類；過氧二硫酸鉀。

本發明製法(g)可在酸之存在下進行。適合此製法之材料為有機酸類，如，例如：甲酸、乙酸、抗壞血酸，及無機酸，如，例如：鹽酸或硫酸。

5 本發明製法(g)可於鹼之存在下進行。適合此製法之材料為有機鹼，如，例如：吡啶、及鹼金屬或鹼土金屬氫氧化物之水溶液，如，例如：氫氧化鈉或氫氧化鉍。

進行本發明製法(g)之反應溫度可在相當大範圍內變化。通常，該製法係於-80°C至 300°C之溫度下進行，較佳為 20°C至 100°C之溫度。

10 進行根據本發明製法(g)以合成式(VII-a)化合物時，每莫耳式(VII-b)硝基化合物通常使用 0.6 至 10 莫耳，較佳為 0.8 至 5 莫耳氧化劑。

15 適合進行根據本發明製法(j)之稀釋劑為所有惰性有機溶劑。較佳溶劑包括脂系、脂環系或芳香系烴類，如，例如：石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或萘烷；鹵化烴類，如，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，如：乙醚、二異丙基醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基  
20 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，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-甲基吡咯啉酮或六甲基磷酸三醯胺。

根據本發明製法(j)必要時係於合適酸受體之存在下進

行。合適酸受體為所有常用之無機或有機鹼類。此等較佳鹼類包括鹼土金屬或鹼金屬氫化物、氫氧化物、胺化物、醇鹽類、乙酸鹽、碳酸鹽或碳酸氫鹽，如，例如：氫化鈉、胺化鈉、甲醇鈉、乙醇鈉、第三丁醇鉀、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、碳酸氫鈉或碳酸銨，與三級胺類，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、重氮雙環辛烷(DABCO)、重氮雙環壬烯(DBN)或重氮雙環十一碳烯(DBU)。

根據本發明製法(j)係於合適鹵化劑之存在下進行。合適鹵化劑為所有此等鹵化反應常用之鹵化劑。可述及例如：鹵化物形成劑，如：碳醯氯、三溴化磷、三氯化磷、五氯化磷、磷醯氯、草醯氯或亞硫醯氯；酸酐形成劑，如：氯甲酸乙酯、氯甲酸甲酯、氯甲酸異丙基酯、氯甲酸異丁基酯或甲磺醯氯；或其他常用之縮合劑，如：五氧化磷、聚磷酸、N,N'-羰基二咪唑、2-乙氧基-1-乙氧基羰基-1,2-二氫喹啉(EEDQ)、三苯基磷/四氯甲烷或溴化三吡咯啶基磷六氟磷酸鹽。

根據本發明製法(j)若必要時，係於觸媒之存在下進行。其實例可述及 4-二甲基胺基吡啶、1-羥基苯并三唑或二甲基甲醯胺。

進行根據本發明製法(j)時，反應溫度可在相當大範圍內變化。通常，該等製法係於 0°C 至 200°C 之溫度下進行，較佳為 0°C 至 150°C 之溫度。

進行根據本發明製法(g)以合成式(VII)化合物時，每莫耳式(XI)羥基衍生物通常使用 0.2 至 10 莫耳，較佳為 0.5 至 5 莫耳鹵化劑。

進行根據本發明製法(k)之稀釋劑為所有惰性有機溶劑。較佳溶劑包括脂系、脂環系或芳香系烴類，如，例如：石油醚、己烷、庚烷、環己烷、甲基環己烷、苯、甲苯、二甲苯或萘烷；鹵化烴類，如，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，如：乙醚、二異丙基醚、甲基第三丁基醚、甲基第三戊基醚、二噁烷、四氫呋喃、1,2-二甲氧基乙烷、1,2-二乙氧基乙烷或苯甲醚，或醯胺類，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-甲基吡咯啉酮或六甲基磷酸三醯胺；醇類，如：甲醇、乙醇、異丙醇。

本發明製法(k)係於合適還原劑之存在下進行。所有常用之無機或有機還原劑均可使用。較佳者包括鹼金屬或鹼土金屬氫化物，如，例如：氫化鈉，或複合氫化物，如，例如：氫化鋰鋁、氫硼化鈉、氰基氫硼化鈉、二異丁基氫化鋁、甲硼烷、乙硼烷或甲硼烷複合物，如，例如：甲硼烷-吡啶，矽烷類，如，例如：三乙基矽烷，金屬類，如，例如：鈉、鋰、鋅、鐵，或氫。

本發明製法(k)可於合適酸或路易斯酸之存在下進行。此等酸-/路易斯酸所媒介之還原反應常用之典型酸類/路易斯酸類均可使用。例如：鹽酸、乙酸、三氟乙酸、三氟化硼或複合之三氟化硼，如，例如：三氟化硼醚合物、三氟

化鋁、三氯化鈾，無機或有機鈦化合物，如，例如：四氯化鈦、四異丙醇鈦。

本發明製法(k)必要時係於觸媒之存在下進行。例如：金屬或金屬鹽類，尤指過渡金屬或其鹽類，如，例如：鈮、鉑、鎳(阮來鎳)、鉍、銻、鐵、鐵、鈷、鈷。此等金屬或金屬鹽類若必要時可結合或塗覆在樹脂或基質材料(如：碳)表面上。

本發明製法(k)之反應溫度可在相當大範圍內變化。通常，該製法係於 0°C 至 200°C 之溫度下進行，較佳為 0°C 至 150°C 之溫度。

使用元素態氫作為還原劑進行本發明製法(k)時，可在相當大壓力範圍下進行。通常，係於氫氣壓 1 至 300 巴下，較佳為 1 至 100 巴下進行。

進行根據本發明製法(k)以合成式(XI)化合物時，每莫耳式(XII)醯化芳香系化合物通常使用 0.2 至 10 莫耳，較佳為 0.5 至 5 莫耳還原劑。

除非另有說明，否則所有根據本發明製法通常係於常壓下進行。然而，亦可在加壓或減壓下進行，通常在 0.1 巴至 10 巴間進行。

根據本發明物質具有強效殺微生物活性且可在作物保護法及原料保護法中，用於控制不要之微生物，如：真菌與細菌。

殺真菌劑可用於作物保護法中控制根腫菌(Plasmodiophoromycetes)、卵菌(Oomycetes)、壺菌

(Chytridiomycetes)、接合菌(Zygomycetes)、子囊菌(Ascomycetes)、擔子菌(Basidiomycetes)與半知菌(Deuteromycetes)。

殺細菌劑可用於作物保護法中控制假單胞菌(Pseudomonadaceae)、根瘤菌(Rhizobiaceae)、腸桿菌(Enterobacteriaceae)、白喉桿菌(Corynebacteriaceae)與鏈黴菌(Streptomycetaceae)。

源自上列菌類之真菌性與細菌性病害之病原菌可述及例如(但不限於)：

黃單胞菌屬(Xanthomonas)如，例如：野油菜黃單胞菌稻變種(Xanthomonas campestris pv. oryzae)；

假單胞菌屬(Pseudomonas)如，例如：丁香假單胞菌(Pseudomonas syringae pv. lachrymans)；

歐文氏菌屬(Erwinia)如，例如：解澱粉歐文氏菌(Erwinia amylovora)；

腐黴菌屬(Pythium)如，例如：終極腐黴(Pythium ultimum)；

疫黴屬(Phytophthora)如，例如：致病疫黴(Phytophthora infestans)；

假霜黴屬(Pseudoperonospora)如，例如：葎草假霜黴(Pseudoperonospora humuli)或古巴假霜黴(Pseudoperonospora cubensis)；

單軸黴屬(Plasmopara)如，例如：葡萄生單軸黴(Plasmopara viticola)；

盤梗黴屬(Bremia)如，例如：萵苣盤梗黴(Bremia lactucae)；

霜黴屬(Peronospora)如，例如：豌豆霜黴(Peronospora pisi)

或薺苔霜黴(*P. brassicae*)；

白粉菌屬(*Erysiphe*) 如，例如：禾白粉菌(*Erysiphe graminis*)；

單絲殼屬(*Sphaerotheca*) 如，例如：蒼耳單絲殼(*Sphaerotheca fuliginea*)；

5 叉絲單囊殼屬(*Podosphaera*) 如，例如：白叉絲單囊殼(*Podosphaera leucotricha*)；

黑星菌屬(*Venturia*) 如，例如：蘋果黑星菌(*Venturia inaequalis*)；

核腔菌屬(*Pyrenophora*) 如，例如：圓核腔菌(*Pyrenophora teres*) 或麥類核腔菌(*P. graminea*)(分生孢子型：  
10 *Drechslera*，同義字：長孺孢屬(*Helminthosporium*))；

孢腔菌屬(*Cochliobolus*) 如，例如：禾孢腔菌(*Cochliobolus sativus*) (分生孢子型：*Drechslera*，同義字：長孺孢屬(*Helminthosporium*))；

15 單胞銹菌屬(*Uromyces*) 如，例如：疣頂單胞銹菌(*Uromyces appendiculatus*)；

柄銹菌屬(*Puccinia*) 如，例如：隱匿柄銹菌(*Puccinia recondita*)；

核盤菌屬(*Sclerotinia*) 如，例如：核盤菌(*Sclerotinia sclerotiorum*)；

腥黑粉菌屬(*Tilletia*) 如，例如：小麥網腥黑粉菌(*Tilletia caries*)；

20 黑粉菌屬(*Ustilago*)如，例如：裸黑粉菌(*Ustilago nuda*)或燕麥黑粉菌(*Ustilago avenae*)；

薄膜革菌屬(*Pellicularia*)如，例如：佐佐木薄膜革菌(*Pellicularia sasakii*)；

梨孢屬(*Pyricularia*)如，例如：稻梨胞(*Pyricularia oryzae*)；

镰孢屬(*Fusarium*)如，例如：大刀镰孢(*Fusarium culmorum*)；

葡萄孢屬(*Botrytis*)如，例如：灰葡萄孢(*Botrytis cinerea*)；  
殼針孢屬(*Septoria*)如，例如：穎枯殼針孢(*Septoria nodorum*)；  
小球腔菌屬(*Leptosphaeria*)穎枯小球腔菌(*Leptosphaeria*  
*nodorum*)；

5 尾孢屬(*Cercospora*)如，例如：變灰尾孢(*Cercospora canescens*)；  
鏈格孢屬(*Altenaria*)如，例如：蕓苔鏈格孢(*Altenaria*  
*brassicae*)；

假尾孢屬(*Pseudocercospora*)如，例如：  
*Pseudocercospora herpotrichoides*；

10 絲核菌屬(*Rhizoctonia species*)，如，例如：立枯絲核菌  
(*Rhizoctonia solani*)。

根據本發明活性物質亦具有極佳之強化植物作用。因此，適合植物內部機動控制不要之微生物侵害。

本文中，咸了解強化植物(誘發抗性)物質指彼等可刺激  
15 植物免疫系統之物質，因此當所處理之植物以後受到不要  
之微生物接種時，對此等微生物具有顯著抗性。

此時，咸了解不要之微生物指植物致病性真菌、細菌  
與病毒。因此，根據本發明物質可在處理一段時間後，當  
被上述病原菌侵害時，用於保護植物。此保護期通常以活  
20 性物質處理後為期 1 至 10 天，以 1 至 7 天較佳。

由於對抗植物病害所需濃度與植物之相容性良好，因此可以處理上述植物之地上部、繁殖枝幹及種子及土壤。

此時，根據本發明化合物對控制穀類病害之效果特別佳，如，例如：對抗柄銹菌及葡萄與蔬果栽培上之病害，

如，例如：對抗葡萄孢、黑星菌或鏈格孢。

根據本發明活性物質亦適合提高作物之收率。此外，其展現低毒性及與植物之良好相容性。

若必要時，根據本發明活性物質在特定濃度及施用率下，亦可用為除草劑，調節植物生長及控制動物害蟲。亦可用為合成其他活性物質之中間物與起始物。

所有植物與植株部份均可根據本發明處理。咸了解，本文中之植物意指所有植物與植物族群，如：需要及不需要之野生植物(雜草)或作物(包括天然作物)。作物可為依傳統植物育種法與最適化方法或利用生物技術及基因技術之方法或此等方法之組合所取得者，包括基因轉殖植物，包括受植物育種者權益保護及未受保護之植物栽培品種。亦咸了解，植株部份意指植物之所有地上部與地下部及器官，如：芽、葉、花與根，可述及之實例為闊葉、針葉、軸、莖、花、果實體、果實、種子、根、塊莖與根莖。植株部份亦包括收穫之材料，與營養性及繁殖性材料，例如：扦插、塊莖、根莖、繁殖枝與種子。

根據本發明使用活性物質處理植物與植株部份之方法為依傳統處理法，直接進行處理，或使化合物作用在其環境、棲息地或庫存空間，例如：浸泡、噴灑、汽化、噴霧、撒播、塗刷，及處理繁殖材料時，特定言之處理種子時，亦可包覆一層或多層包衣。

保護原料時，根據本發明化合物可用於保護工業原料，對抗不要之微生物感染及破壞。

本文中之工業原料咸了解係指工業用之無生命材料。例如：需要根據本發明化合物保護免於微生物變化或破壞之工業材料可為膠黏劑、膠水、紙張與紙板、紡織品、皮革、木材、塗料與塑膠物品、冷卻潤滑劑及其他可能被微生物感染或破壞之材料。可能因微生物繁殖而受損之生產系統零件，如：冷卻水循環管線，亦在本發明之材料保護範圍內。本發明範圍內可述及之工業材料為膠黏劑、膠水、紙張與紙板、皮革、木材、塗料、冷卻潤滑劑及熱傳導液體較佳，以木材特別佳。

可分解或改變工業原料之微生物可述及例如：細菌、真菌、酵母、藻類及黏質生物體。根據本發明活性物質可優先對抗真菌，尤指對抗霉菌、使木材變色及破壞木材之真菌(擔子菌(Basidiomycetes))，及對抗黏質生物體與藻類。

可述及例如：下列類屬之微生物：

鏈格孢(*Alternaria*)如：細鏈格孢(*Alternaria tenuis*)，

曲黴(*Aspergillus*)如：黑曲黴(*Aspergillus niger*)，

毛殼(*Chaetomium*)如：球毛殼(*Chaetomium globosum*)，

孢格菌(*Coniophora*)如：粉孢革菌(*Coniophora puetana*)，

香菇(*Lentinus*)如：虎皮香菇(*Lentinus tigrinus*)，

綠青黴(*Penicillium*)如：灰綠青黴(*Penicillium glaucum*)，

多孔菌(*Polyporus*)如：變色多孔菌(*Polyporus versicolor*)，

短梗黴(*Aureobasidium*)如：出芽短梗黴(*Aureobasidium pullulans*)，

*Sclerophoma* 菌如：*Sclerophoma pityophila*，

木黴(*Trichoderma*)如：綠色木黴(*Trichoderma viride*)，

桿菌(*Escherichia*)如：大腸桿菌(*Escherichia coli*)，  
假單胞菌(*Pseudomonas*)如：銅綠假單胞菌(*Pseudomonas aeruginosa*)，及  
葡萄球菌(*Staphylococcus*)如：金黃色葡萄球菌  
(*Staphylococcus aureus*)。

依活性物質之特定物理與/或化學性質而定，其可轉化成一般調配物，如：溶液、乳液、懸浮液、粉劑、泡沫劑、糊劑、粒劑、氣霧劑與含於聚合物質中之微包埋劑，及用於種子之包衣組合物，及超低體積低溫與加溫霧化調配物。

彼等調配物係依已知方法製造，例如：混合活性物質與補充劑，即液態溶劑、加壓液化氣體與/或固態載劑，視需要可使用界面活性劑，即乳化劑與/或勻散劑與/或發泡劑。若使用水作為補充劑時，亦可使用例如：有機溶劑作為溶解助劑。主要採用之液態溶劑如下：芳香族如：二甲苯、甲苯或烷基苯類、氯化芳香族或氯化脂族烴類如：氯苯、氯化乙烯或二氯甲烷、脂族烴類如：環己烷或石蠟類例如：石油分餾物，醇類如：丁醇或乙二醇及其醚類與酯類，酮類如：丙酮、甲基乙基酮、甲基異丁基酮或環己酮，強極性溶劑，如：二甲基甲醯胺及二甲亞砷，及水。液化氣體補充劑或載劑咸了解係指在常溫與常壓下呈氣態之液體，例如：氣霧劑推進劑，如：鹵化烴，及丁烷、丙烷、氮氣與二氧化碳。適用之固態載劑為：例如：天然礦物磨粉，如：高嶺土、黏土、滑石、白堊、石英、白土、蒙脫土或矽藻土，及合成礦物磨粉如：高分散性矽石、礬土與

矽酸鹽類。適用於粒劑之固態載劑為例如：粉碎與分碎之天然礦石，如：方解石、大理石、浮石、海泡石、白雲石，及無機與有機細粉類之合成顆粒；及有機物質之顆粒如：鋸屑，椰子殼，玉米穗軸與煙草桿。適用之乳化劑與/或發  
5 泡劑為例如：非離子性與陰離子性乳化劑如：聚氧乙烯脂肪酸酯類、聚氧乙烯脂肪醇醚類，例如：烷芳基聚乙二醇醚類、磺酸烷基酯類、硫酸烷基酯類、磺酸芳基酯及蛋白質水解產物。適用之勻散劑為例如：木質素亞硫酸鹽廢液與甲基纖維素。

10 調配物中亦可使用結合劑如：羧甲基纖維素、天然及合成聚合物之粉末、顆粒或似膠乳型，如：阿拉伯膠、聚乙烯醇與聚乙酸乙烯酯及天然磷脂如：腦磷脂與卵磷脂，及合成磷脂類。其他可用之添加物為：礦物油與蔬菜油。

15 可能使用染色劑如：無機色素，例如：氧化鐵，氧化鈦與普魯士藍，及有機染料，如：茜素染料，偶氮染料及金屬酞花青染料及微量營養素如：鐵、錳、硼、銅、鈷、鉬與鋅之鹽類。

調配物中通常包含 0.1 至 95 重量%活性物質，以 0.5 至 90 重量%之間較佳。

20 根據本發明活性物質可呈其本身使用，或形成調配物使用，亦可與已知殺真菌劑、殺細菌劑、殺蜚蟊劑、殺線蟲劑或殺昆蟲劑形成混合物，以例如：擴大活性範圍或防止產生抗性。有時候，可得到增效效果，亦即，混合物之有效性高於個別成分之有效性。

互補調配成分實例包括：

殺真菌劑：

2-苯基苯酚；8-羥基噻林硫酸鹽；艾苯拉(acibenzolar)-S-甲  
基；艾狄莫(aldimorph)；安伏滅(amidoflumet)；安伏斯  
5 (ampropylfos)；安伏斯鉀(ampropylfos-potassium)；安得靈  
(andoprim)；安拉辛(anilazine)；阿克唑(azaconazole)；阿斯  
本(azoxystrobin)；本達樂(benalaxyl)；本達樂-M；苯諾丹  
(benodanil)；免賴德(benomyl)；苯賽卡(benthiavalicarb)-異  
丙基；苯賽克(benzamacril)；苯賽克(benzamacril)-異丁基；  
10 百拉斯(bilanafos)；百蟎克(binapacryl)；聯苯；拜坦諾  
(bitertanol)；保米黴素(blasticidin)-S；布康唑  
(bromuconazole)；布滅莫(bupirimate)；得滅多(buthiobate)；  
丁基胺；多硫化鈣；卡普黴素(capsimycin)；四氯丹  
(captafol)；蓋普丹(captan)；卡苯辛(carbendazim)；卡布辛  
15 (carboxin)；卡普醯胺(carpropamid)；卡吩(carvone)；蟎離  
丹(chinomethionat)；克本松(chlobenthiazone)；克吩唑  
(chlorfenazole)；氯尼(chloroneb)；四氯異苯腈  
(chlorothalonil)；氯唑內(chlozolate)；克拉肯(clozylacon)；  
賽發滅(cyazofamid)；賽吩滅(cyflufenamid)；西莫尼  
20 (cymoxanil)；西普康唑(cyproconazole)；西迪尼  
(cyprodinil)；賽伏南(cyprofuram)；代格(Dagger) G；迪布  
卡(debacarb)；益發靈(dichlofluanid)；地克隆(dichlone)；二  
氯吩(dichlorophen)；地克賽(diclocymet)；地克美辛  
(diclomezine)；地克爛(dicloran)；地吩卡(diethofencarb)；

地吩康唑(difenoconazole)；地伏靈(diflumetorim)；地滅利  
 (dimethirimol)；地滅莫(dimethomorph)；地斯本  
 (dimoxystrobin)；地康唑(diniconazole)；地康唑-M；白粉克  
 (dinocap)；二苯基胺；二吡松(dipyrithione)；地嗒伏斯  
 5 (ditalimfos)；腈硫醯(dithianon)；多寧(dodine)；查索農  
 (drazoxolon)；護粒松(edifenphos)；環氧克唑  
 (epoxiconazole)；抑本散(ethaboxam)；抑利莫(ethirimol)；  
 抑得唑(etridiazole)；芬色丹(famoxadone)；芬滅酮  
 (fenamidone)；芬普尼(fenapanil)；芬利莫(fenarimol)；芬康  
 10 唑(fenbuconazole)；芬伏爛(fenfuram)；芬赫醯胺  
 (fenhexamid)；芬唑本(fenitropan)；芬散尼(fenoxanil)；芬  
 比克尼(fenpiclonil)；芬普定(fenpropidin)；芬普福  
 (fenpropimorph)；富爾邦(ferbam)；扶吉胺(fluazinam)；伏  
 本明(flubenzimine)；伏克尼(fludioxonil)；伏特夫  
 15 (flumetover)；伏莫(flumorph)；氟醯胺(fluoromide)；伏斯本  
 (fluoxastrobin)；伏克康唑(fluquinconazole)；伏米得  
 (flurprimidol)；護矽得(flusilazole)；護硫醯胺  
 (flusulphamide)；護坦尼(flutolanil)；護汰芬(flutriafol)；福  
 爾培(folpet)；福賽德(fosetyl)-A1；福賽德鈉；伏嗒唑  
 20 (fuberidazole)；伏拉希(furalaxyl)；福滅普(furametpyr)；護  
 卡尼(furcarbanil)；護克斯(furmecyclox)；免熱淨  
 (guazatine)；六氯苯；赫康唑(hexaconazole)；殺紋寧  
 (hymexazole)；依滅列(imazalil)；抑本康唑  
 (imibenconazole)；抑康定(iminoctadine)三乙酸鹽；抑克定-

阿見酸鹽(iminoctadine albesilate)；碘卡(iodocarb)；抑普康  
 唑(ipconazole)；丙基喜樂松(iprobenfos)；依普同  
 (iprodione)；抑發利(iprovalicarb)；依麻黴素(irumamycin)；  
 亞賜普醇烷(isoprothiolane)；異弗二酮(isovaledione)；賜黴  
 素(kasugamycin)；克辛甲酯(kresoxim-methyl)；錳粉克  
 (mancozeb)；錳乃浦(maneb)；滅芬松(meferimzone)；米本  
 靈(mepanipyrim)；米普尼(mepronil)；滅達樂(metalaxyl)；  
 滅達樂-M；滅康唑(metconazole)；滅速卡  
 (methasulphocarb)；滅伏散(methfuroxam)；滅得賴  
 (metiram)；滅速本(metominostrobin)；滅速發  
 (metsulphovax)；米得黴素(mildiomycin)；麥克坦尼  
 (myclobutanil)；麥克靈(myclozolin)；納坦黴素(natamycin)；  
 尼克本(nicobifen)；硝基太(nitrothal)-異丙基；諾化能  
 (noviflumuron)；紐莫(nuarimol)；歐弗斯(ofurace)；歐斯本  
 (orysastrobin)；歐殺斯(oxadixyl)；啞唎酸(oxolinic acid)；  
 啞康唑(oxpoconazole)；嘉得信(oxycarboxin)；歐芬汀  
 (oxyfenthiin)；巴克素(paclobutrazole)；比菲唑  
 (pefurazoate)；本康唑(penconazole)；賓克隆(pencycuron)；  
 伏斯定(phosdiphen)；苯酞；比克斯本(picoxystrobin)；比特  
 靈(piperalin)；保粒黴素(polyoxins)；保粒靈(polyoxorim)；  
 普本唑(probenazole)；撲克拉(prochloraz)；撲滅寧  
 (procymidone)；普莫卡(propamocarb)；普辛鈉  
 (propanosine-sodium)；普克利(propiconazole)；甲基鋅乃浦  
 (propineb)；普克奇(proquinazid)；普賽康唑

(prothioconazole)；普克斯本(pyraclostrobin)；白粉松  
 (pyrazophos)；比芬斯(pyrifenox)；比坦尼(pyrimethanil)；  
 百快隆(pyroquilon)；普希弗(pyroxyfur)；吡咯靈  
 (pyrrolenitrine)；快康唑(quinconazole)；克辛芬  
 5 (quinoxifen)；奎脫辛(quintozene)；辛康唑(simeconazole)；  
 賜必安(spiroxamine)；硫；得克利(tebuconazole)；特克爛  
 (tecloftalam)；特辛(tecnazene)；特賽利(tetcyclacis)；特康  
 唑(tetraconazole)；腐絕(thiabendazole)；地賽芬(thicyofen)；  
 地伏醯胺(thifluzamide)；甲基多保淨(thiophanate-methyl)；  
 10 得恩地(thiram)；地歐西(tioxymid)；甲基脫克松  
 (tolclofos-methyl)；特伏利(tolylfluanid)；三泰芬  
 (triadimefon)；三泰隆(triadimenol)；三本地(triazbutil)；三  
 唑氧(triazoxide)；三環醯胺(tricyclamide)；三賽唑  
 (tricyclazole)；三得芬(tridemolph)；三伏素(trifloxystrobin)；  
 15 三伏唑(triflumizole)；賽福寧(triforine)；三狄康唑  
 (triticonazole)；.優康唑(uniconazole)；維利黴素(validamycin)  
 A；免克寧(vinclozolin)；鋅乃浦(zineb)；益穗(ziram)；索  
 醯胺(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-[(甲磺醯基)胺基]-丁醯  
 20 胺；1-(1-萘基)-1H-吡咯-2,5-二酮；2,3,5,6-四氯-4-(甲磺醯基)  
 吡啶；2-胺基-4-甲基-N-苯基-5-噁唑羧醯胺；2-氯-N-(2,3-  
 二氫-1,1,3-三甲基-1H-茛-4-基)-3-吡啶羧醯胺；3,4,5-三氯  
 -2,6-吡啶甲腈；抑克定(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-節-1-基)-1H-咪唑-5-羧酸甲酯；碳酸一鉀鹽；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]癸烷-3-胺；四硫代碳酸鈉；與銅鹽及製劑，如，波爾多混合物(Bordeaux mixture)；氫氧化銅；茶甲酸銅；鹼性氯氧化銅；硫酸銅；庫發尼(cufraneb)；氧化銅；錳銅製劑(mancopper)；快得寧(oxine-copper)。

### 殺細菌劑：

布普諾(bronopol)、二氯吩(dichlorophen)、尼普林(nitrapyrin)、二甲基二硫代胺甲酸鎳、賜黴素(kasugamycin)、歐力農(octhilinone)、呋喃羧酸、氧四環速(oxytetracyclin)、撲殺熱(probenazole)、鏈黴素(streptomycin)、特可嗒(tecloftalam)、硫酸銅與其他銅製劑。

### 殺昆蟲劑/殺蜚蟊劑/殺線蟲劑：

#### 1. 乙醯基膽鹼酯酶(AChE)抑制劑

1.1 胺甲酸酯類(如：安利卡(alanycarb)、得滅克(aldicarb)、亞得卡(aldoxycarb)、利西卡(allyxycarb)、安明卡(aminocarb)、亞滅伏(azamethiphos)、本得卡(bendiocarb)、本伏卡(benfuracarb)、必克蟲(bufencarb)、布得卡(butacarb)、布卡辛(butocarboxim)、丁氧羰基、加保利(carbaryl)、加保扶(carbofuran)、丁基加保扶(carbosulfan)、克特卡(chloethocarb)、庫伏斯(coumaphos)、施力松

(cyanofenphos)、氰乃松(cyanophos)、地特爛(dimetilan)、抑芬卡(ethiofencarb)、芬布卡(fenobucarb)、芬特卡(fenothiocarb)、覆滅蟎(formetanate)、伏賽卡(furathiocarb)、滅必蝨(Isoprocarb)、金屬鈉、滅賜克(methiocarb)、納乃得(methomyl)、滅特卡(metolcarb)、歐殺滅(oxamyl)、比加普(pirimicarb)、必加普(promecarb)、安丹(propoxur)、硫敵克(thiodicarb)、硫芬斯(thiofanox)、三辛滅(triazamate)、三滅卡(trimethacarb)、XMC 與賽利卡(xylylcarb))

- 1.2 有機磷酸鹽類 (如：歐殺松(acephate)、亞滅伏(azamethiphos)、谷速松(azinphos)(-甲基、-乙基)、溴磷松(bromophos)-乙基、溴芬松(bromfenvinfos)(-甲基)、丁硫松(butathiofos)、卡速松(cadusafos)、加芬松(carbophenothion)、氯乙松(chlorethoxyfos)、氯芬松(chlorfenvinphos)、氯滅松(chlormephos)、陶斯松(chlorpyrifos)(-甲基、-乙基)、庫伏斯(coumaphos)、施力松(cyanofenphos)、氰乃松(cyanophos)、氯芬松(chlorfenvinphos)、滅賜松(demeton)-S-甲基、滅賜松(demeton)-S-甲基砒、得拉松(dialifos)、大利松(diazinon)、二氯芬松(dichlofenthion)、二氯松(dichlorvos)/DDVP、雙特松(dicrotophos)、大滅松(dimethoate)、大芬松(dimethylvinphos)、大本松(dioxabenzofos)、二硫松

(disulfoton)、EPN、愛殺松(ethion)、普伏松(ethoprophos)、益多松(etrifos)、凡伏(famphur)、芬滅松(fenamiphos)、撲滅松(fenitrothion)、繁福松(fensulfothion)、芬殺松(fenthion)、芬普松(flupyrzofos)、大福松(fonofos)、福木松(formothion)、福滅靈(fosmethilan)、福賽特(fosthiazate)、飛達松(heptenophos)、抑芬松(iodofenphos)、抑本松(iprobenfos)、抑賽松(isazofos)、抑伏松(isofenphos)、鄰水楊酸異丙基酯、抑殺松(isoxathion)、馬拉松(malathion)、滅加松(mecarbam)、滅卡松(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)、歐滅賜松(oxydemeton)-甲基、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)、福賜卡(phosphocarb)、巴賽松(phoxim)、亞特松(pirimiphos)(-甲基、-乙基)、佈飛松(profenofos)、加護松(propaphos)、普丹松(propetamphos)、普硫松(prothiofos)、飛克松(prothoate)、必伏松(pyraclofos)、必芬松(pyridaphenthion)、必達松(pyridathion)、拜裕松(quinalphos)、西佈松(sebufos)、速伏特(sulfotep)、速普松(sulprofos)、特

必松 (tebupirimfos)、亞培松 (temephos)、托福松 (terbufos)、四氯松 (tetrachlorvinphos)、硫滅松 (thiometon)、三落松 (triazophos)、三氯松 (triclorfon)、繁米松 (vamidothion))

## 2. 鈉通道調節劑/與電壓相關之鈉通道阻斷劑

2.1 擬除蟲菊類 (如：艾克靈 (acrinathrin)、亞特靈 (allethrin)(d-順式-反式, d-反式)、 $\beta$ -賽扶寧 (cyfluthrin)、畢芬寧 (bifenthrin)、必利靈 (bioallethrin)、必利靈 (bioallethrin)-S-環戊基-異構物、必抑寧 (bioethanomethrin)、必滅寧 (biopermethrin)、必賽靈 (bioresmethrin)、克發普靈 (chlovaporthrin)、順式-賽滅寧 (cypermethrin)、順式-利滅寧 (resmethrin)、順式-普滅寧 (permethrin)、克賽林 (clocythrins)、乙氰菊酯 (cycloprothrin)、賽扶寧 (cyfluthrin)、賽洛寧 (cyhalothrin)、賽滅寧 (cypermethrin)( $\alpha$ -、 $\beta$ -、 $\theta$ -、 $\zeta$ -)、賽芬寧 (cyphenothrin)、DDT、第滅寧 (deltamethrin)、依普靈 (empenthrin)(1R-異構物)、益化利 (esfenvalerate)、依芬寧 (etofenprox)、芬福寧 (fenfluthrin)、芬普寧 (fenpropathrin)、芬吡靈 (fenpyrithrin)、芬化利 (fenvalerate)、福本賽寧 (flubrocycythrinate)、護賽寧 (flucythrinate)、伏芬普斯 (flufenprox)、伏滅寧 (flumethrin)、福化利 (fluvalinate)、伏本斯 (fubfenprox)、 $\gamma$ -賽洛寧 (cyhalothrin)、益普靈

(imiprothrin)、卡得靈(kadethrin)、 $\lambda$ -賽洛寧(cyhalothrin)、滅伏特靈(metofluthrin)、(順式-、反式-)百滅寧(permethrin)、芬特寧(phenothrin)(1R-反式異構物)、普烈靈(prallethrin)、普伏靈(profluthrin)、普奇芬(protrifenbute)、必滅靈(pyresmethrin)、利滅靈(resmethrin)、RU-15525、希拉芬(silafluofen)、特福化利(tau-fluvalinate)、特伏靈(tefluthrin)、特美鈴(terallerthrin)、特滅靈(tetramethrin)(IR-異構物)、泰滅寧(tralomethrin)、參伏靈(transfluthrin)、ZXI 8901、除蟲菊精(pyrethrum)

2.2 噁二吡類(如：英賽普(indoxacarb))

3. 乙醯基膽鹼受體促效劑/拮抗劑

3.1 氯菸鹼類(chloronicotinyis)/類新菸鹼類(neonicotinoides)(如：乙醯普(acetamiprid)、克利定(clothianidin)、第諾芬(dinotefuran)、益達胺(imidacloprid)、尼普爛(nitenpyram)、尼賽辛(nithiazine)、硫克必(thiacloprid)、賽滅松(thiamethoxam))

3.2 尼古丁、本速達(bensultap)、培丹(cartap)

4. 乙醯基膽鹼受體調節劑

4.1 速必辛類(Spinosyns)(如：賜諾殺(spinosad))

5. GABA-控制之氯離子通道拮抗劑

5.1 環二烯有機氯(如：克飛氯(camphenchlor)、克丹(chlordane)、安殺番(endosulfan)、 $\gamma$ -HCH、HCH、

飛達克 (heptachlor)、靈丹 (lindane)、甲氧基氯 (methoxychlor)

5.2 飛普洛類(Fiprols) (如：亞普洛(acetoprole)、抑普洛(ethiprole)、芬普洛(fipronil)、凡普洛(vaniliprole))

5 6. 氯離子通道活化劑

6.1 滅克定類(Mectins)(如：亞滅克定(abamectin)、艾滅克定(ivermectin)、抑滅克定(emamectin)、抑滅克定苯甲酸鹽、抑伏滅定(ivermectin)、米滅克定(milbemectin)、美保黴素(milbemycin))

10 7. 幼保激素擬似物(如：地芬爛(diofenolan)、抑普芬(epofenonane)、芬歐卡(fenoxycarb)、赫普靈(hydroprene)、克普靈(kinoprene)、滅普靈(methoprene)、必普芬(pyriproxifen)、三普靈(triprene))

15 8. 脫皮激素促效劑/瓦解劑

8.1 二醯基肼類(如：克麻賽(chromafenozide)、赫芬賽(halofenozide)、甲氧芬賽(methoxyfenozide)、特芬賽(tebufenozide))

9. 幾丁質生合成抑制劑

20 9.1 苯甲醯基脲類(如：必賽伏(bistrifluron)、克伏能(chlofluazuron)、地伏能(diflubenzuron)、伏賽能(fluzuron)、福環脲(flucycloxuron)、氟芬隆(flufenoxuron)、赫姆能(hexaflumuron)、利芬能(lufenuron)、利化能(novaluron)、諾化能

(noviflumuron)、本伏能 (penfluron)、特速能 (teflubenzuron)、三伏能 (triflumuron))

9.2 佈芬辛 (Buprofezin)

9.3 賽麻辛 (Cyromazine)

10. 氧化性磷酸化反應之抑制劑，ATP 瓦解劑

10.1 地芬能 (Diafenthiuron)

10.2 有機錫類 (如：亞賽錫 (azocyclotin)、賽赫錫 (cyhexatin)、芬嗒錫 (fenbutatin) 氧化物)

11. 干擾質子梯度之氧化性磷酸化反應之去偶合劑

11.1 吡咯類 (如：克芬吡 (chlorfenapyr))

11.2 二硝基苯酚類 (如：百蟎克 (binapacryl)、大脫蟎 (dinobuton)、白粉克 (dinocap)、DNOC)

12. I 位置電子傳遞抑制劑

12.1 METIs (如：芬賽昆 (fenazaquin)、芬普賽滅 (fenpyroximate)、普靈芬 (pyrimidifen)、必達本 (pyridaben)、達芬必 (tebufenpyrad)、特芬必 (tolfenpyrad))

12.2 海滅能 (Hydramethylnone)

12.3 大克蟎 (Dicofol)

13. II 位置電子傳遞抑制劑

13.1 魚藤精 (Rotenone)

14. III 位置電子傳遞抑制劑

14.1 亞克希 (Acequinocyl)、伏克靈 (fluacrypyrim)

15. 昆蟲腸膜之微生物瓦解劑

蘇雲金芽胞桿菌(*Bacillus thuringiensis*)菌種

16. 脂肪合成抑制劑

16.1 季酮酸類(如：螺克芬(spirodiclofen)、螺滅芬(spiromesifen))

5 16.2 特胺酸(Tetramic acids)[如：3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲  
氧基-2-氧代基-1-氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙基碳酸  
酯(又稱：碳酸 3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲氧基-2-氧代  
基-1-氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙酯，CAS 登錄號  
382608-10-8)與碳酸順式-3-(2,5-二甲基苯基)-8-甲  
10 氧基-2-氧代基-1-氮雜螺[4.5]癸-3-烯-4-基乙酯(CAS  
登錄號 203313-25-1)]

17. 羧醯胺類(如：伏卡滅(flonicamid))

18. 章魚胺激導性促效劑(如：三亞蟎(amitraz))

19. 鎂刺激之 ATPase 抑制劑(如：歐蟎多(propargite))

15 20. 酞醯胺類(如：N<sup>2</sup>-[1,1-二甲基-2-(甲基磺醯基)乙基]-3-  
碘-N<sup>1</sup>-[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 登錄號 272451-65-7)，伏本  
二醯胺(Flubendiamide))

21. 沙蚤毒素類似物(如：硫賜安(thiocyclam hydrogen  
20 oxalate)、硫賜嗒鈉鹽(thiosultap-sodium))

22. 生物有機體、激素或費洛蒙(如：查得定  
(azadirachtin)、桿菌屬(*Bacillus spec.*)、白僵菌屬  
(*Beauveria spec.*)、克得蒙(codlemone)、綠僵菌屬  
(*Metarrhizium spec.*)、擬青黴屬(*Paecilomyces*

spec.)、蘇雲金芽胞桿菌素(thuringiensin)、輪枝胞屬  
(Verticillium spec.))

23. 作用機轉未知或非專一性之活性物質

23.1 氣體處理介質(如：磷化鋁、甲基溴、硫醯氯)

23.2 選擇性抗攝食劑(如：克利得(cryolite)、伏卡滅  
(flonicamid)、必滅辛(pymetrozine))

23.3 蟎生長抑制劑(如：克芬辛(clofentezine)、抑特唑  
(etoxazole)、海賽唑(hexythiazox))

23.4 安伏滅(amidoflomet)、苯克賽(benclothiaz)、苯賽滅  
(benzoximate)、必芬賽(bifenazate)、丙酸溴  
(bromopropylate)、佈芬辛(buprofezin)、蟎離丹  
(chinomethionat)、克敵芬(chlordimeform)、克本烈  
(chlorobenzilate)、克普靈(chloropicrin)、克賽本  
(clothiazoben)、殺佈蟎(cycloprene)、賽特芬  
(cyflumetofen)、地克尼(dicyclanil)、芬克靈  
(fenoxacrim)、芬奇凡(fentrifanil)、伏本明  
(flubenzimine)、伏芬靈(flufenerim)、伏丹辛  
(flutenzin)、格希普(gossyplure)、海滅能  
(hydramethylnone)、亞普烈(japonilure)、滅嗒松  
(metoxadiazone)、石油、胡椒基丁醚、油酸鉀、必  
飛普(pyrafluprole)、必達烈(pyridalyl)、必普  
(pyriprole)、速伏滅(sulfluramid)、特達芬  
(tetradifon)、特速(tetrasul)、散安靈(triarathene)、菲  
佈汀(verbutin)。

及化合物 3-甲基苯基丙基胺甲酸酯(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-登錄號  
185982-80-3)與相應之3-環內橋接-異構物(CAS-登  
錄號 185984-60-5)(參見 WO-96/37494, WO-98/25923),  
與包含具殺昆蟲活性之植物萃出物、線蟲、真菌或  
病毒之製劑。

亦可與其他已知活性物質如：除草劑，或與肥料及生  
長調節劑、安全劑與/或化學信息物質形成混合物。

此外，根據本發明式(I)化合物亦具有極佳之抗霉菌活  
性。其特別對皮真菌與酵母、霉菌及雙相型真菌(例如：對  
抗假絲酵母屬(*Candida*)，如：白假絲酵母(*Candida*  
*albicans*)，團假絲酵母(*Candida glabrata*))，及絮狀表皮癬菌  
(*Epidermophyton floccosum*)、曲黴屬(*Aspergillus*)如：黑曲  
黴(*Aspergillus niger*)與煙曲黴(*Aspergillus fumigatus*)、髮癬  
菌屬(*Trichophyton*)如：鬚髮癬菌(*Trichophyton*  
*mentagrophytes*)，小孢黴屬(*Microsporon*)如：狗小孢黴  
(*Microsporon canis*)與頭癬小孢黴(*Microsporon audouinii*)  
具有廣譜抗霉菌效力。此等真菌絕未限制其霉菌範圍，僅  
供說明用。

活性物質可呈其本身形式使用或呈其調配物形式或由  
調配物製成之形式使用，如：現成可用之溶液、懸浮液、  
噴灑用粉劑、糊劑、可溶性粉劑、細粉劑與粒劑。其可依  
一般方式施用，例如：澆水、噴灑、噴霧、撒播、撒粉、

發泡、散播，等等。亦可採用超低體積法施用活性物質，或注射活性物質本身至土壤中。亦可處理植物之種子。

當使用根據本發明活性物質作為殺真菌劑時，其施用率可在相當大範圍內變化，端賴施用形式而定。處理植物植株時，活性物質之施用率通常在 0.1 至 10,000 克/公頃之間，較佳為 10 至 1000 克/公頃之間。處理種子時，活性物質之施用率通常在 0.001 至 50 克/公斤種子之間，較佳為 0.01 至 10 克/公斤種子之間。處理土壤時，活性物質之施用率通常在 0.1 至 10,000 克/公頃之間，較佳為 1 至 5000 克/公頃之間。

如上述，根據本發明可處理所有植物與其部份植株。較佳具體實施例中係處理野生植物品種與植物栽培品種，及彼等由傳統生物育種法(如：交配法或原生質融合法)取得者，與其部份植株。另一項較佳具體實施例中，係處理由遺傳工程(若適當時，可併用傳統方法)得到之轉殖基因植物與植物栽培品種(基因改造生物)，及其部份植株。術語"部份"或"植株部份"或"部份植株"已如上述說明。

特別佳者，根據本發明係處理自商品取得或使用中之植物栽培品種之植物。咸了解，"植物栽培品種"意指經由傳統育種法、誘變法或重組 DNA 技術得到之具有新穎性質("特性")之植物。其可為生物型或基因型栽培品種。

依植物品種或植物栽培品種、其位置與生長條件(土壤、氣候、營養生長循環、肥料)而異，根據本發明處理法亦可能產生增效性效果。因此，可能超過預期之效果為例

如：降低施用率與/或擴大活性範圍與/或提高根據本發明所使用物質與製劑之活性、更佳之植物生長、提高對高溫或低溫之耐受性、提高對乾旱或對水含量或土壤鹽含量之耐受性、提高開花率、提早收成、加速成熟、提高收穫量、提高所收成產品之品質與/或提高營養價值、改善儲存特性與/或所收成產品之可加工性。

最好根據本發明處理之轉殖基因植物或植物栽培品種(亦即彼等由遺傳工程取得者)包括所有於基因改造過程中，接受賦與特別優點("特性")之基因材料之植物。此等特性實例為更佳之植物生長、提高對高溫或低溫之耐受性、提高對乾旱或對水含量或土壤鹽含量之耐受性、提高開花率、提早收成、加速成熟、提高收穫量、提高所收成產品之品質與/或提高營養價值、改善儲存特性與/或所收成產品之可加工性。其他及特別強調之此等特性實例為植物對抗動物與微生物害蟲之更佳防禦性，如：對抗昆蟲、螨、植物病原性真菌、細菌與/或病毒，亦提高植物對某些除草活性物質之耐受性。可述及之轉殖基因植物實例為重要作物，如：穀類(小麥、稻)、玉米、大豆、馬鈴薯、棉花、菸草、油菜與果實植物(蘋果、梨、柑橘與葡萄)，特別著重於玉米、大豆、馬鈴薯、棉花、菸草與油菜。特別強調之特性為利用植株內所形成毒素，尤指來自蘇雲金芽胞桿菌(*Bacillus thuringiensis*)之遺傳物質(例如：基因 CryIA(a)、CryIA(b)、CryIA(c)、CryIIA、CryIIIA、CryIIIB2、Cry9c、Cry2Ab、Cry3Bb 與 CryIF 及其組合)於植株內所形成之毒

素(下文中稱為"Bt 植物")提高對抗昆蟲、蟬蟎、線蟲與蠕蟲之防禦性。亦特別強調之特性為利用後天取得之全株抗性(SAR)、系統素(systemin)、植物抗毒素、誘發素(elicitors)與抗性基因，及相應表現之蛋白質與毒素，提高對抗真菌、細菌與病毒之防禦性。其他特別強調之特性為提高植物對某些除草活性物質，例如：咪唑啉酮類、磺醯脲類、草甘膦(glyphosate)或膦三辛(phosphinotricin)之耐受性(例如："PAT"基因)。此等賦與所需特性之基因亦可相互組合進入轉殖基因植物中。"Bt 植物"實例可述及以下列商品名稱出售之玉米品種、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)。除草劑耐受性植物實例可述及以下列商品名稱出售之玉米品種、棉花品種與大豆品種：Roundup Ready®(耐受草甘膦，例如：玉米、棉花、大豆)、Liberty Link®(耐受膦三辛(phosphinotricin)，例如：油菜)、IMI®(耐受咪唑啉酮類)與 STS®(耐受磺醯脲類，例如：玉米)。可述及之除草劑抗性植物(依傳統育種法育種而耐受除草劑之植物)包括以下列商品名稱出售之品種：Clearfield®(例如：玉米)。當然，此等說明亦適用於已具有此等遺傳特性或仍待發展出此等遺傳特性，將於未來發展與/或上市之植物栽培品種。

上列植物使用根據本發明通式(I)化合物或活性物質混合物處理時，特別有效。上述活性物質或混合物之較佳範

圍亦適用於處理此等植物。特別強調以本文中明確說明之化合物或混合物處理植物。

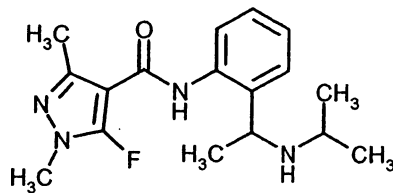
根據本發明活性物質之合成與用途將於下列實例中說明。

## 【實施方式】

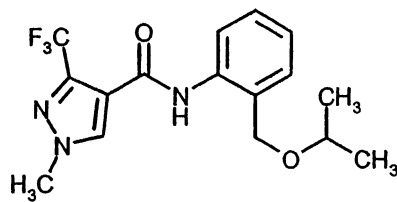
根據本發明活性物質之合成與用途將於下列實例中說明。

### 合成實例

#### 編號 40 化合物之合成法



取含 0.27 克(1.5 毫莫耳) 5-氟-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-羧基氯之 10 毫升二氯甲烷溶液滴加至含 0.27 克(1.5 毫莫耳) 2-[1-(異丙基胺基)乙基]苯胺(III-4)與 0.42 毫升(3.0 毫莫耳) 三乙胺之 5 毫升二氯甲烷溶液中。於 50°C 下攪拌反應混合物 2 小時後，於室溫下 16 小時。加水至反應混合物中後，有機相經硫酸鎂脫水與真空濃縮。經管柱層析 (4:1 己烷/丙酮)，產生 0.27 克(產率理論值之 56%) 5-氟-N-{2-[1-(異丙基胺基)乙基]苯基}-1,3-二甲基-1H-吡唑-4-羧醯胺 [ $\log P$  (pH 2.3) = 0.58]。

編號 60 化合物之合成法

5

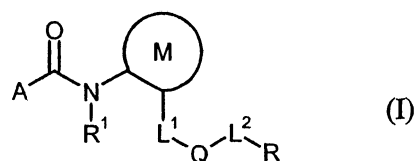
添加 156.0 毫克(3.9 毫莫耳) 含 60% 氫化鈉之油至室溫  
 下，含 897.8 毫克(3.0 毫莫耳)N-[2-(羥基甲基)苯基]-1-甲  
 基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-羧醯胺 (IV-1) 之 2 毫升二甲  
 基甲醯胺溶液中。30 分鐘後，添加 0.6 毫升(6.0 毫莫耳) 2-  
 碘丙烷。於 100°C 下攪拌反應混合物 6 小時後，於室溫下  
 16 小時。然後，以 1 毫升甲醇稀釋混合物，加至水中，以  
 以乙酸乙酯萃取；有機相經硫酸鎂脫水，濾出脫水劑，殘  
 質真空濃縮。經管柱層析 (3:1 環己烷/乙酸乙酯)，產生  
 100.0 毫克(產率理論值之 9.7 %)N-[2-(異丙氧基甲基)苯基]-1-  
 甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-羧醯胺 [ $\log P$  (pH 2.3) = 2.85]。

10

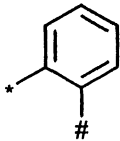
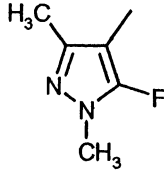
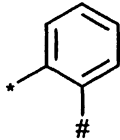
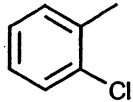
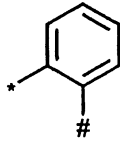
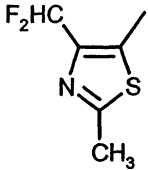
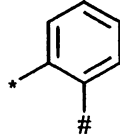
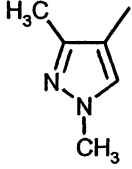
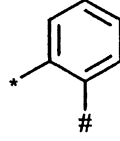
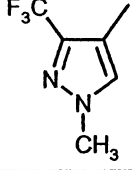
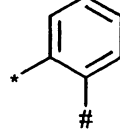
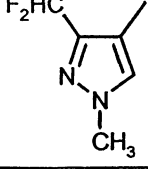
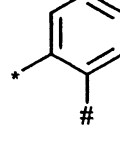
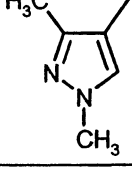
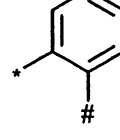
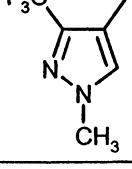
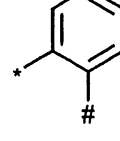
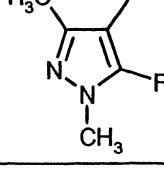
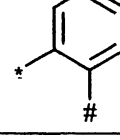
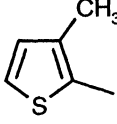
15

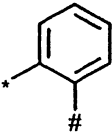
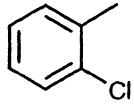
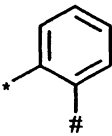
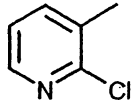
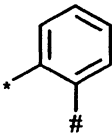
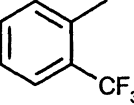
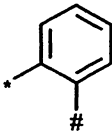
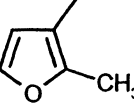
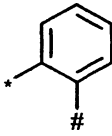
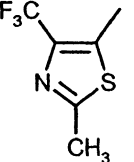
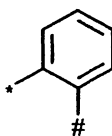
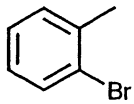
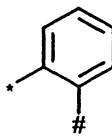
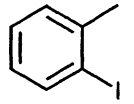
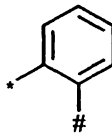
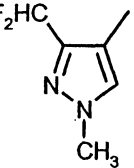
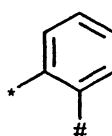
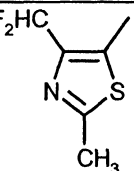
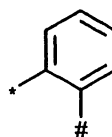
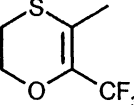
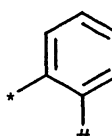
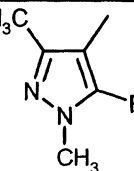
下表 1 所列化合物可類似實例 1 與 2 之方法，及依據  
 本發明合成法(a)至(m)之一般說明製得：

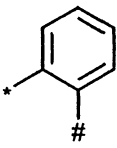
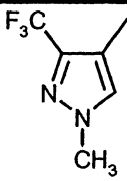
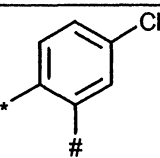
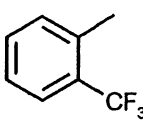
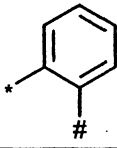
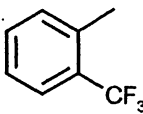
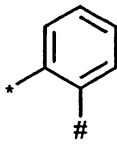
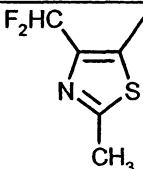
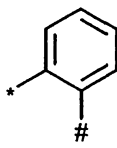
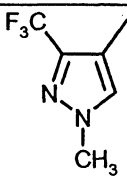
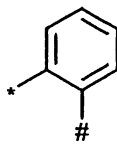
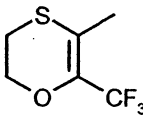
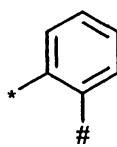
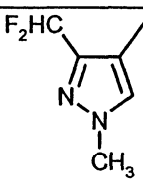
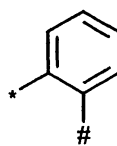
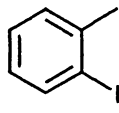
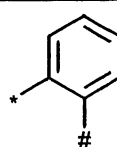
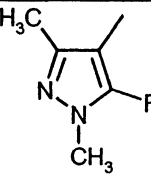
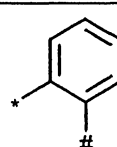
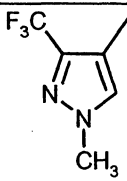
表 1

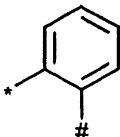
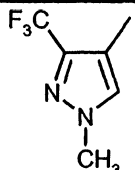
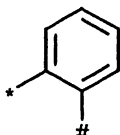
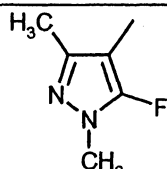
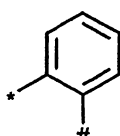
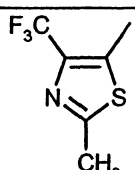
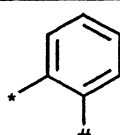
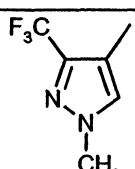
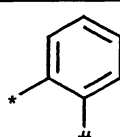
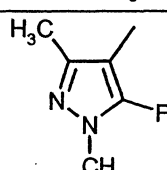
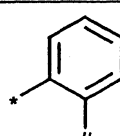
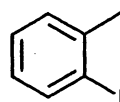
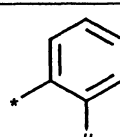
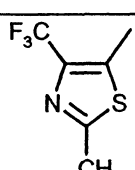
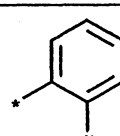
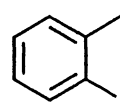
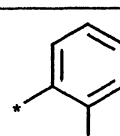
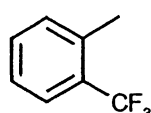
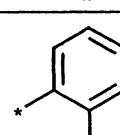
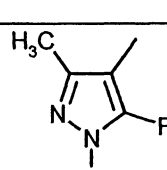


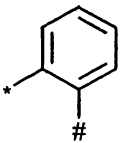
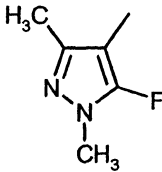
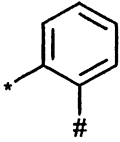
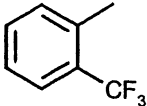
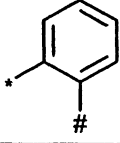
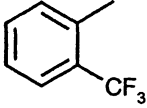
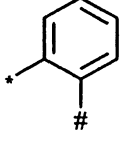
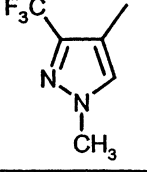
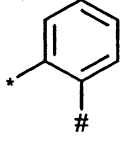
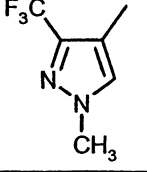
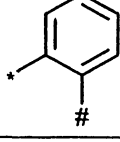
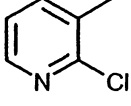
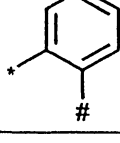
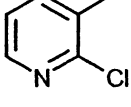
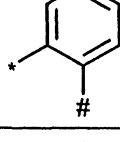
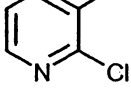
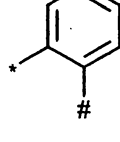
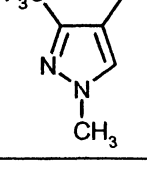
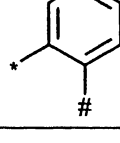
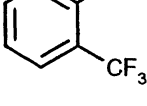
| No. | R <sup>1</sup> | M | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                                        | A | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|---|--------------------------------------------------------------------------|---|--------------------------|
| 1   | H              |   | -CH <sub>2</sub> -O-CH <sub>3</sub>                                      |   | 2.18                     |
| 2   | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |   | 2.07                     |
| 3   | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |   | 2.30                     |
| 4   | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |   | 2.38                     |
| 5   | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |   | 1.68                     |
| 6   | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |   | 2.53                     |
| 7   | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |   | 2.43                     |
| 8   | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |   | 2.21                     |
| 9   | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |   | 2.35                     |
| 10  | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |   | 2.39                     |

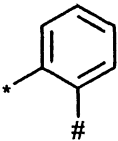
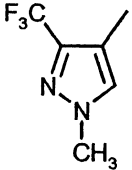
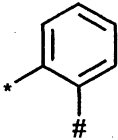
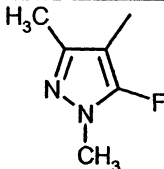
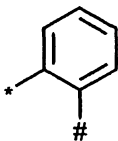
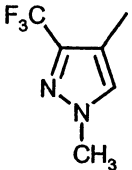
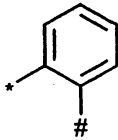
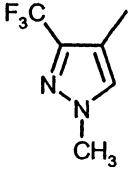
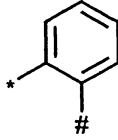
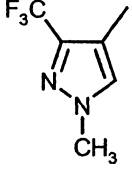
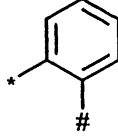
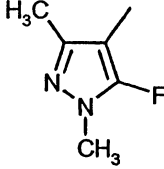
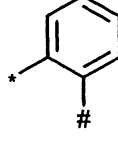
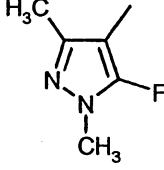
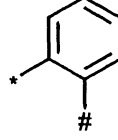
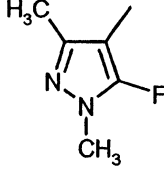
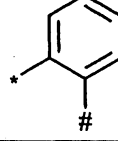
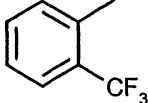
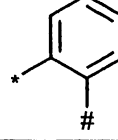
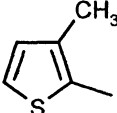
| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                                        | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 11  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |    | 1.66                     |
| 12  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |    | 2.23                     |
| 13  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |    | 2.16                     |
| 14  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |   | 1.46                     |
| 15  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  | 2.09                     |
| 16  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-SO <sub>2</sub> -CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  | 1.86                     |
| 17  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                |  | 2.53                     |
| 18  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                |  | 3.27                     |
| 19  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                |  | 2.98                     |
| 20  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                |  | 4.03                     |

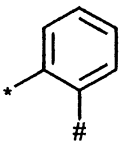
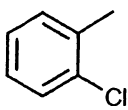
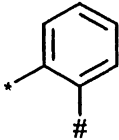
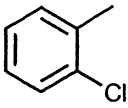
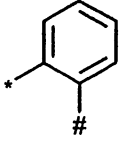
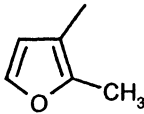
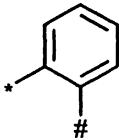
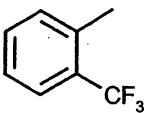
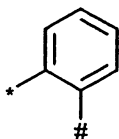
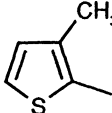
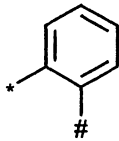
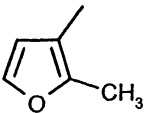
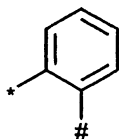
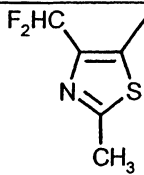
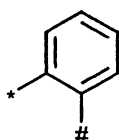
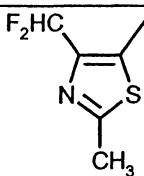
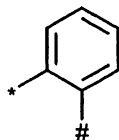
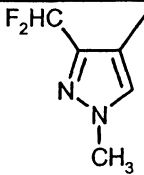
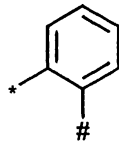
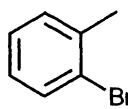
| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                         | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 21  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |    | 3.74                     |
| 22  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |    | 2.95                     |
| 23  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |    | 3.90                     |
| 24  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |    | 3.71                     |
| 25  | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |   | 3.73                     |
| 26  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  | 3.79                     |
| 27  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  | 3.91                     |
| 28  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  | 3.01                     |
| 29  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  | 3.55                     |
| 30  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  | 3.76                     |
| 31  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH <sub>3</sub>                   |  | 2.17                     |

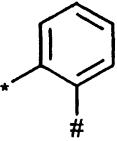
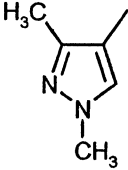
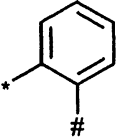
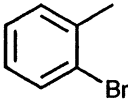
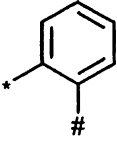
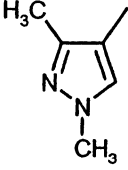
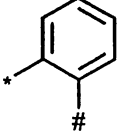
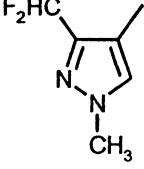
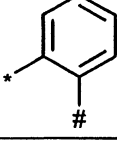
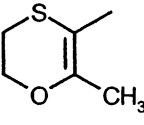
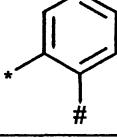
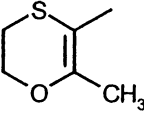
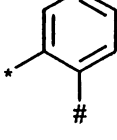
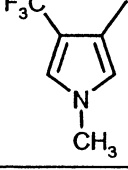
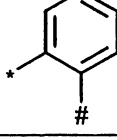
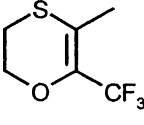
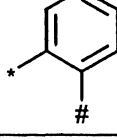
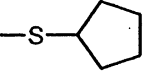
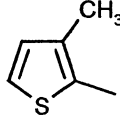
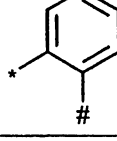
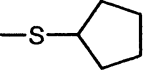
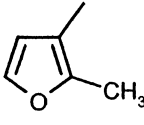
| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                          | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 32  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH <sub>3</sub>                    |    | 2.46                     |
| 33  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH <sub>3</sub>                    |    | 3.56                     |
| 34  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH <sub>3</sub>                    |    | 2.99                     |
| 35  | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      |    | 3.27                     |
| 36  | H              |   | -CH <sub>2</sub> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      |   | 3.05                     |
| 37  | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      |  | 3.48                     |
| 38  | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      |  | 2.76                     |
| 39  | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>      |  | 3.68                     |
| 40  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-NH-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  | 0.58                     |
| 41  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-NH-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  | 1.06                     |

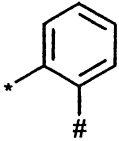
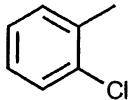
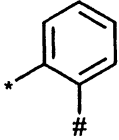
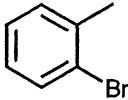
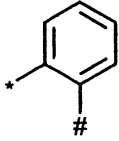
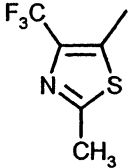
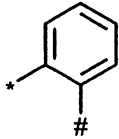
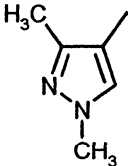
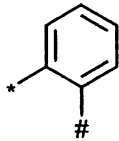
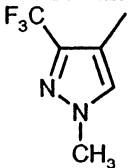
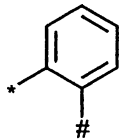
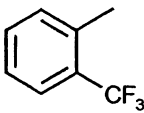
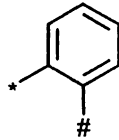
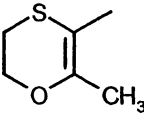
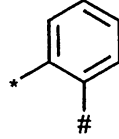
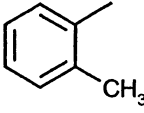
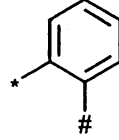
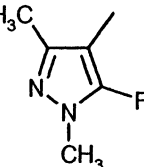
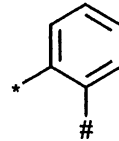
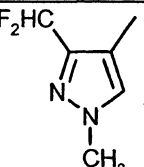
| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                                                           | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 42  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    | 4.02                     |
| 43  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    | 3.82                     |
| 44  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    | 4.52                     |
| 45  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |   | 4.14                     |
| 46  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |  | 3.38                     |
| 47  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | 4.75                     |
| 48  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |  | 4.12                     |
| 49  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |  | 4.33                     |
| 50  | H              |  | -CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CHCl <sub>2</sub>                                                  |  | 3.15                     |
| 51  | H              |  | -CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                  |  | 2.39                     |

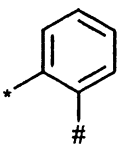
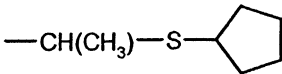
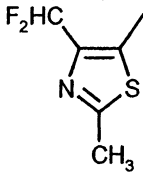
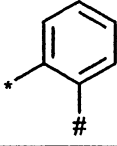
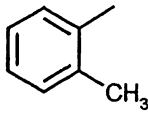
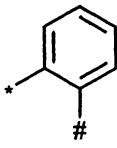
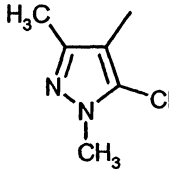
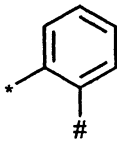
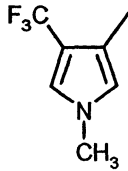
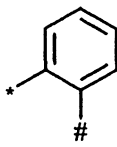
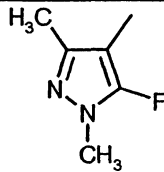
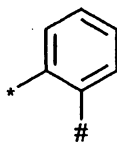
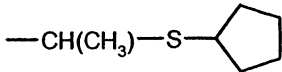
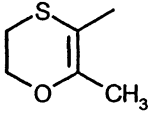
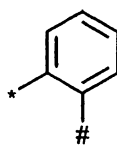
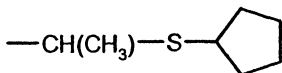
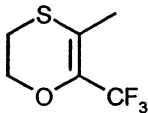
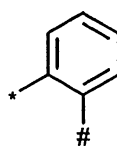
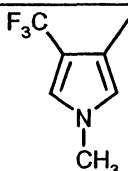
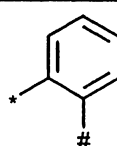
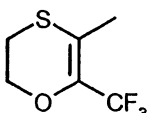
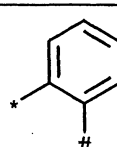
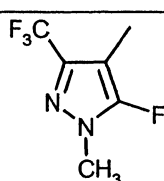
| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                                                         | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 52  | H              |    | -CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CHCl <sub>2</sub>                                                |    | 2.36                     |
| 53  | H              |    | -CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                |    | 3.24                     |
| 54  | H              |    | -CH <sub>2</sub> -O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                     |    | 2.51                     |
| 55  | H              |    | -CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                |    | 2.74                     |
| 56  | H              |  | -CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CHCl <sub>2</sub>                                                |   | 2.69                     |
| 57  | H              |  | -CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                |  | 2.38                     |
| 58  | H              |  | -CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CHCl <sub>2</sub>                                                |  | 2.38                     |
| 59  | C(O)i-Pr       |  | -CH <sub>2</sub> -O-C(O)-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                |  | 3.49                     |
| 60  | H              |  | -CH <sub>2</sub> -O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                                     |  | 2.85                     |
| 61  | H              |  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> C(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -O-C(O)-CH <sub>3</sub> |  | 3.30                     |

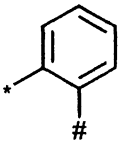
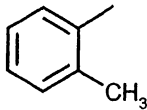
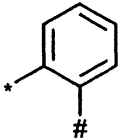
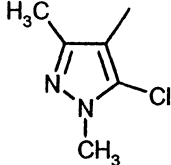
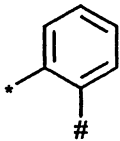
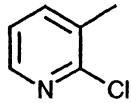
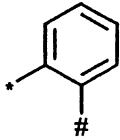
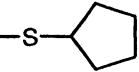
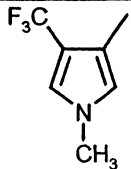
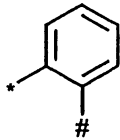
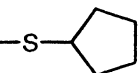
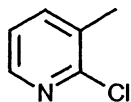
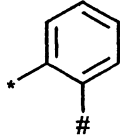
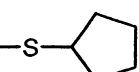
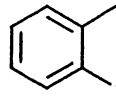
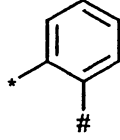
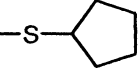
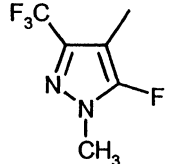
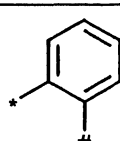
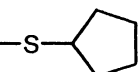
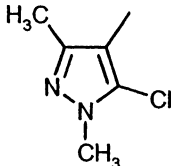
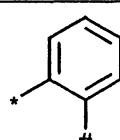
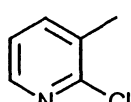
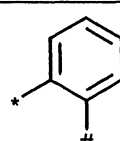
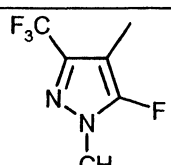
| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                                                                       | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 62  | H              |    | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH                                                                     |    | 1.62                     |
| 63  | H              |    | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH                                                                     |    | 1.21                     |
| 64  | H              |    | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-C(O)-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              |    | 2.79                     |
| 65  | H              |   | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |   | 4.59                     |
| 66  | H              |  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-C(O)-CHCl <sub>2</sub>                                              |  | 2.76                     |
| 67  | H              |  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-C(O)-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                              |  | 2.40                     |
| 68  | H              |  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-C(O)-CHCl <sub>2</sub>                                              |  | 2.43                     |
| 69  | H              |  | -(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -O-Si(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> -C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> |  | 4.49                     |
| 70  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>             |  | 4.71                     |
| 71  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>             |  | 4.93                     |

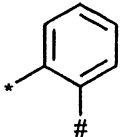
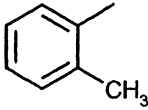
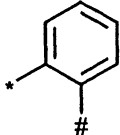
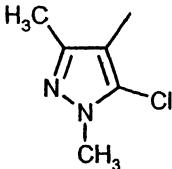
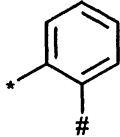
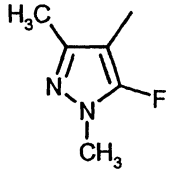
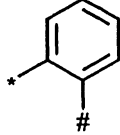
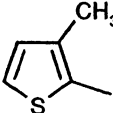
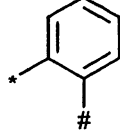
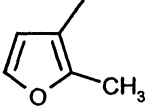
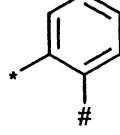
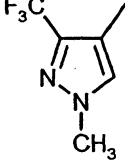
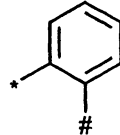
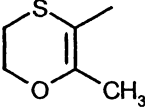
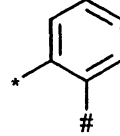
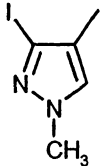
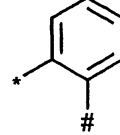
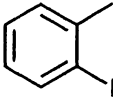
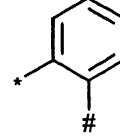
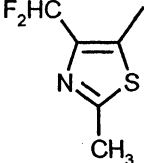
| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                                                           | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 72  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    | 4.60                     |
| 73  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |    | 4.17                     |
| 74  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |    | 4.17                     |
| 75  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |    | 4.31                     |
| 76  | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |   | 4.47                     |
| 77  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | 4.61                     |
| 78  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |  | 3.95                     |
| 79  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | 4.36                     |
| 80  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                 |  | 3.38                     |
| 81  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | 4.63                     |

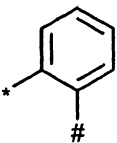
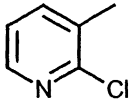
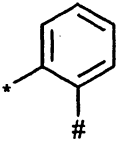
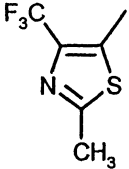
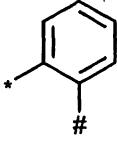
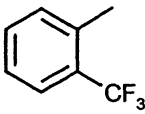
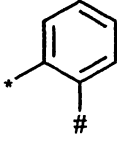
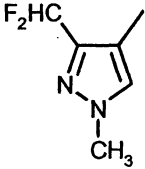
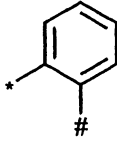
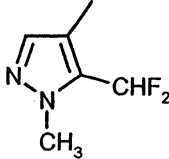
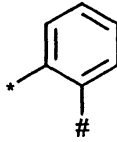
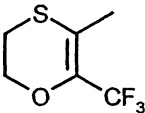
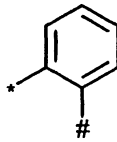
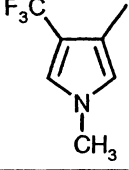
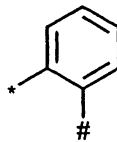
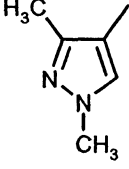
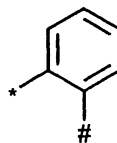
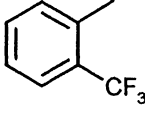
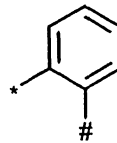
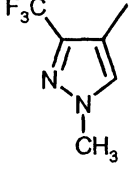
| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                                                                             | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 82  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   |    | 3.27                     |
| 83  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                   |    | 4.21                     |
| 84  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                   |    | 2.90                     |
| 85  | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   |   | 3.76                     |
| 86  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                   |  | 4.07                     |
| 87  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   |  | 4.53                     |
| 88  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                   |  | 3.92                     |
| 89  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                   |  | 4.10                     |
| 90  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-  |  | 3.16                     |
| 91  | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-  |  | 4.31                     |

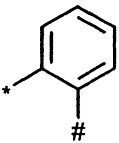
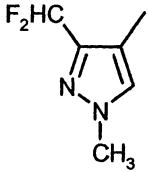
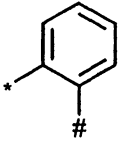
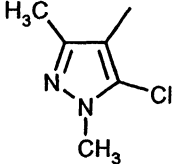
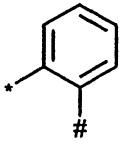
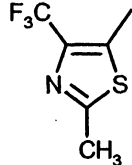
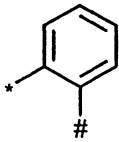
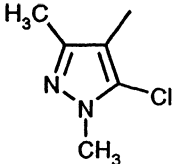
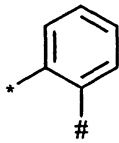
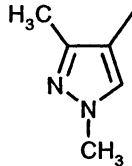
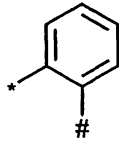
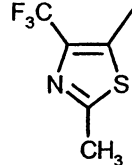
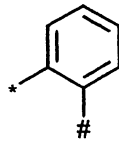
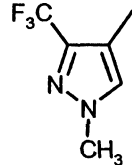
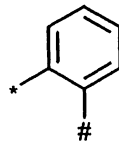
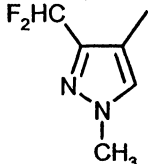
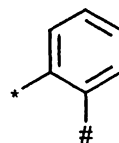
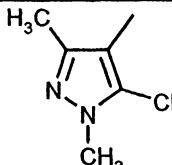
| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                                                                                        | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 92  | H              |    | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-$    |    | 4.29                     |
| 93  | H              |    | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-$    |    | 4.34                     |
| 94  | H              |    | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-$    |    | 4.24                     |
| 95  | H              |    | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-$    |    | 3.04                     |
| 96  | H              |  | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-$  |   | 3.76                     |
| 97  | H              |  | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-$  |  | 4.41                     |
| 98  | H              |  | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$                                                              |  | 3.65                     |
| 99  | H              |  | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-$  |  | 4.44                     |
| 100 | H              |  | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-$  |  | 4.03                     |
| 101 | H              |  | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-$  |  | 3.48                     |

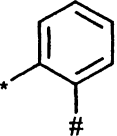
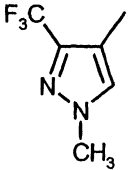
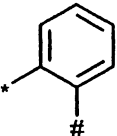
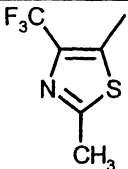
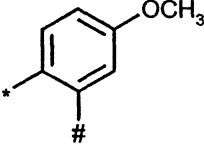
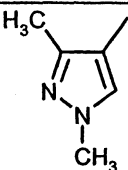
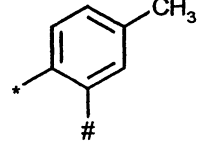
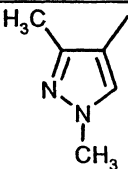
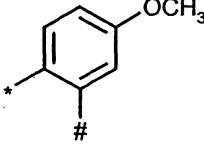
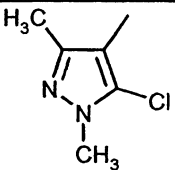
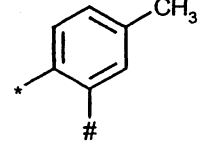
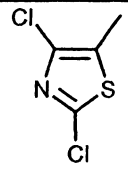
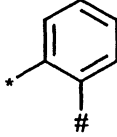
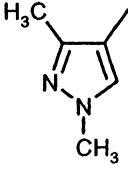
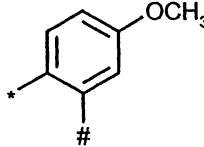
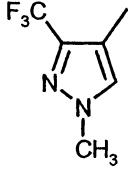
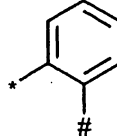
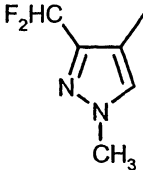
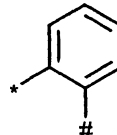
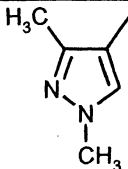
| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                                                                                        | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 102 | H              |    | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-$    |    | 4.07                     |
| 103 | H              |    | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$                                                              |    | 3.88                     |
| 104 | H              |    | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$                                                              |    | 3.20                     |
| 105 | H              |    | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$                                                              |   | 3.57                     |
| 106 | H              |  | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)_2$                                                              |  | 3.63                     |
| 107 | H              |  | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-$  |  | 4.24                     |
| 108 | H              |  | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-$  |  | 4.21                     |
| 109 | H              |  | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$                                      |  | 4.29                     |
| 110 | H              |  | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$                                      |  | 4.49                     |
| 111 | H              |  | $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{S}-\text{CH}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2)_2\text{CH}_3$                                      |  | 4.38                     |

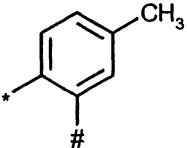
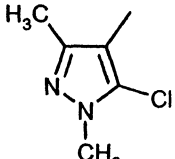
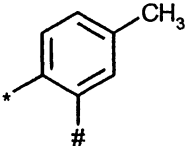
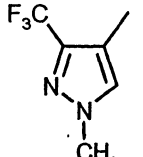
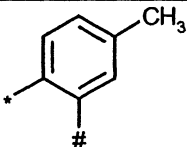
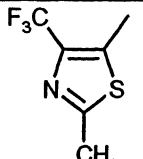
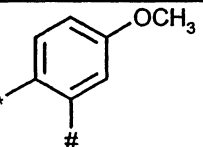
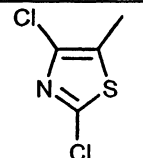
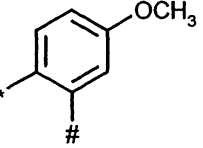
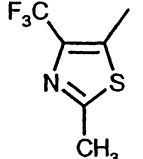
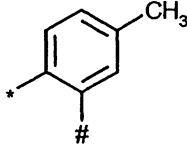
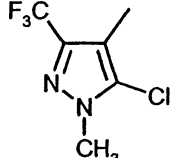
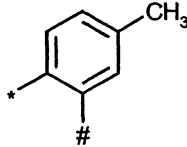
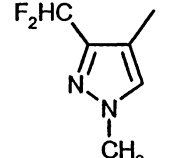
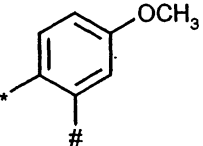
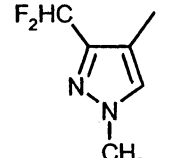
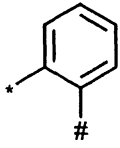
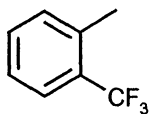
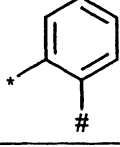
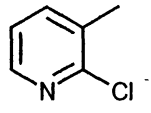
| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                                                                             | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 112 | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   |    | 4.76                     |
| 113 | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   |    | 4.07                     |
| 114 | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   |    | 3.79                     |
| 115 | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-    |    | 4.02                     |
| 116 | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-  |  | 3.46                     |
| 117 | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-  |  | 4.45                     |
| 118 | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-  |  | 4.12                     |
| 119 | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-  |  | 3.76                     |
| 120 | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                   |  | 3.35                     |
| 121 | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                                   |  | 3.99                     |

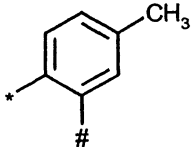
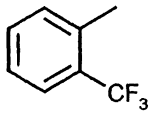
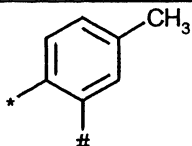
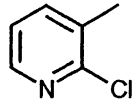
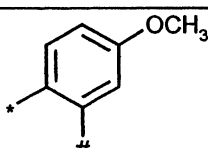
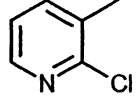
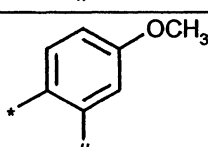
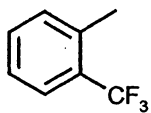
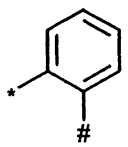
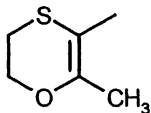
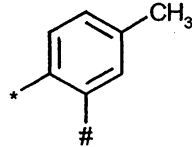
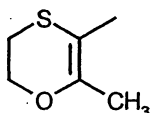
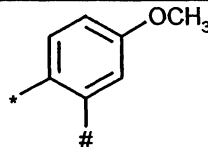
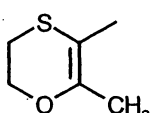
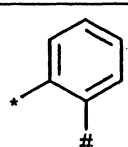
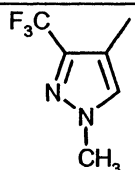
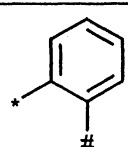
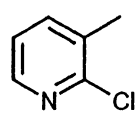
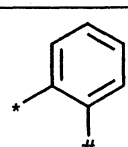
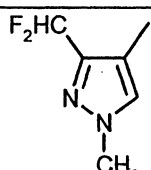
| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                                           | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 122 | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    | 4.31                     |
| 123 | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    | 3.60                     |
| 124 | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   |    | 2.90                     |
| 125 | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   |    | 4.50                     |
| 126 | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   |  | 3.80                     |
| 127 | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   |  | 3.14                     |
| 128 | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   |  | 3.47                     |
| 129 | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   |  | 2.75                     |
| 130 | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   |  | 3.83                     |
| 131 | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>                   |  | 3.58                     |

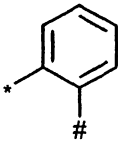
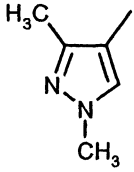
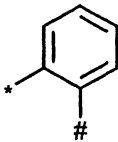
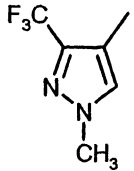
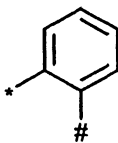
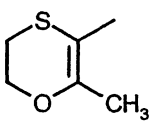
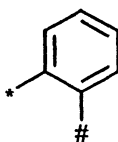
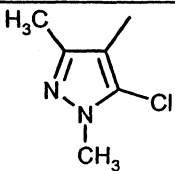
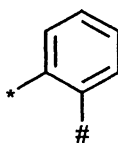
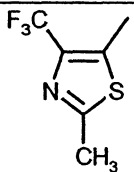
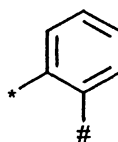
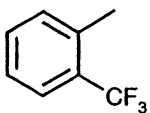
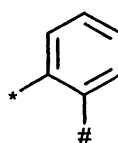
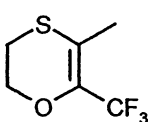
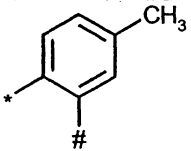
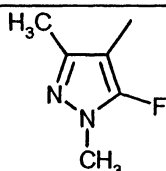
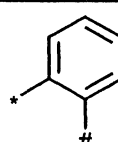
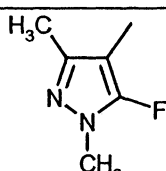
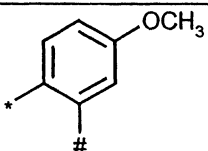
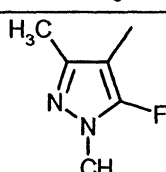
| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                         | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 132 | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |    | 2.72                     |
| 133 | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |    | 3.65                     |
| 134 | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |    | 3.81                     |
| 135 | H              |    | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |    | 2.89                     |
| 136 | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  | 3.67                     |
| 137 | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  | 3.64                     |
| 138 | H              |  | -CH(CH <sub>3</sub> )-O-CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  | 5.60                     |
| 139 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>        |  | 98°C                     |
| 140 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>        |  |                          |
| 141 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>       |  |                          |

| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                                  | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 142 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                |    | 103°C                    |
| 143 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                |    | 96°C                     |
| 144 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                |    |                          |
| 145 | H              |   | -CH <sub>2</sub> -SO-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>               |   |                          |
| 146 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                |  | 105°C                    |
| 147 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -SO-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>               |  |                          |
| 148 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -SO-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>               |  |                          |
| 149 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -SO-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>               |  |                          |
| 150 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | 148°C                    |

| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                                  | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 151 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    | 135°C                    |
| 152 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    | 142°C                    |
| 153 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                |    | 142°C                    |
| 154 | H              |   | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                |   | 116°C                    |
| 155 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                |  | 125°C                    |
| 156 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                |  | 72°C                     |
| 157 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  |                          |
| 158 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                |  | 135°C                    |
| 159 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -SO <sub>2</sub> -CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | 143°C                    |
| 160 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -SO-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>               |  |                          |

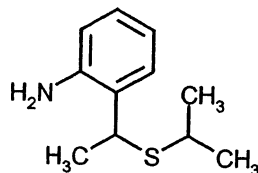
| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                   | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 161 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    | 127°C                    |
| 162 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                          |
| 163 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |    |                          |
| 164 | H              |   | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   | 116°C                    |
| 165 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | 98°C                     |
| 166 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | 132°C                    |
| 167 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | 86°C                     |
| 168 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | 110°C                    |
| 169 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | 79°C                     |
| 170 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |  | 75°C                     |

| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                                     | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 171 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   |    | 105°C                    |
| 172 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   |    | 112°C                    |
| 173 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   |    | 138°C                    |
| 174 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   |    | 120°C                    |
| 175 | H              |   | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   |   | 71°C                     |
| 176 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   |  |                          |
| 177 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   |  | 68°C                     |
| 178 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -OH                                                  |  | 1.61                     |
| 179 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  | 92°C                     |
| 180 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  |                          |

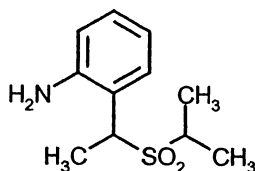
| No. | R <sup>1</sup> | M                                                                                   | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                                     | A                                                                                     | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|-------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------|
| 181 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |    | 86°C                     |
| 182 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |    | 82°C                     |
| 183 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |    | 45°C                     |
| 184 | H              |    | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |   |                          |
| 185 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  |                          |
| 186 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  | 94°C                     |
| 187 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  | 77°C                     |
| 188 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   |  | 96°C                     |
| 189 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> |  |                          |
| 190 | H              |  | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>                   |  | 147°C                    |

| No. | R <sup>1</sup> | M | -L <sup>1</sup> QL <sup>2</sup> R                       | A | logP (pH 2.3)<br>MP (°C) |
|-----|----------------|---|---------------------------------------------------------|---|--------------------------|
| 191 | H              |   | -CH <sub>2</sub> -S-CH <sub>3</sub>                     |   |                          |
| 192 | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                          |
| 193 | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                          |
| 194 | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                          |
| 195 | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                          |
| 196 | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                          |
| 197 | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                          |
| 198 | H              |   | -CH(CH <sub>3</sub> )-S-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> |   |                          |

<sup>a)</sup> 以星號(“\*”)表示之鍵結係與醯胺鏈結。

式(III)起始物之合成法實例(III-1)

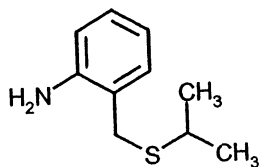
取 44 克(0.188 莫耳) 1-[1-(異丙硫基)乙基]-2-硝基苯(VII-1)溶於 250 毫升乙醇中，與 3 克阮來鎳混合，於室溫下，在高壓釜中使用 3 巴氫氣氫化 6 小時。6 小時後，再加 3 克阮來鎳，續於室溫下，使用 3 巴氫氣氫化 16 小時。過濾排除觸媒，真空排除溶劑。粗產物經管柱層析法純化(矽膠，3：1 己烷/甲基第三丁基醚)。得到 32 克(以 HPLC 測得純度 97.3%，產率理論值之 84.4%)2-[1-(異丙硫基)乙基]苯胺之黃色油狀物[logP (pH2.3 )= 2.45]。

實例(III-2)

取含 16.2 克(60.5 毫莫耳) 1-[1-(異丙基磺醯基)乙基]-2-硝基苯(VII-4) 之 160 毫升甲醇溶液置入加裝攪拌器與溫度計之 500 毫升三頸燒瓶中，與 160 毫升濃鹽酸攪拌混合，於 20-40℃ 下分批添加 31.5 克錫粉(265.2 毫莫耳)，續於 40℃

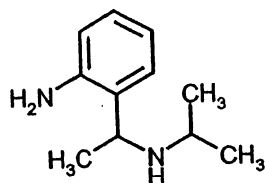
下攪拌混合物約 1 小時。反應冷卻，過濾，與 1575 毫升冰冷之 10% 氫氧化鈉溶液混合。以二氯甲烷萃取 2 次，經硫酸鈉脫水，真空排除溶劑。產生 13.3 克(以 HPLC 測得純度 95.8%，產率理論值之 92.6%) 2-[1-(異丙基磺基)乙基]苯胺[logP (pH 2.3) = 1.28].

### 實例(III-3)

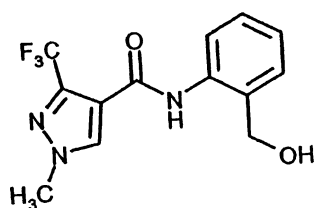


取含 11.8 克(55.6 毫莫耳) 1-[1-(異丙硫基)甲基]-2-硝基苯(VII-2)之 150 毫升甲醇置入加裝攪拌器與溫度計之 500 毫升三頸燒瓶中，與 150 毫升濃鹽酸攪拌混合，於 20-40°C 下分批添加 17.6 克錫粉(48.5 毫莫耳)，續於 40°C 下攪拌混合物約 1 小時。反應冷卻，過濾，與 1300 毫升冰冷之 10% 氫氧化鈉溶液混合。以二氯甲烷萃取 2 次，經硫酸鈉脫水，真空排除溶劑。粗產物經矽膠使用 3:1 己烷/甲基第三丁基醚純化。得到 4.6 克(以 HPLC 測得純度 94.6%，產率理論值之 43.2%) 2-[1-(異丙硫基)甲基]苯胺之黃色油狀物[logP (pH 2.3) = 1.94]。

## 實例(III-4)



取含 5 克(24 毫莫耳) N-[1-(2-硝基苯基)乙基]丙烷-2-胺(VII-5)之 30 毫升甲醇溶液與 0.5 克阮來鎳混合，於 50℃ 下，在高壓釜中，使用 50 巴氫氣氫化 5 小時。冷卻後，過濾排除觸媒，真空排除溶劑。產生 2.8 克(以 HPLC 測得純度 98.1%，產率理論值之 64.2%) 2-[1-(異丙基胺基)乙基]苯胺[logP (pH 2.3) = 0.05]。

式(IV)起始物之合成法實例(IV-1)

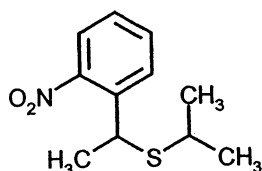
於室溫下，取含 34.5 克(0.16 莫耳) 1-甲基-3-三氟甲基-1H-吡唑-4-羧基氯之 50 毫升四氫呋喃溶液滴加至含 20.0 克(0.16 莫耳)2-胺基苯基甲醇與 36 毫升(0.26 莫耳)三乙胺之 250 毫升四氫呋喃溶液中。停止放熱後，反應回流 6 小時，然後再於室溫下攪拌 48 小時。添加反應混合物至約 250

毫升水中，以乙基乙酯萃取，以 2 N 鹽酸洗滌，經硫酸鎂脫水及真空濃縮。經管柱層析(環己烷/乙酸乙酯梯度)，產生 33.8 克(產率理論值之 69%)N-[2-(羥基甲基)苯基]-1-甲基-3-(三氟甲基)-1H-吡唑-4-羧醯胺 [ $\log P$  (pH 2.3) = 1.55]。

5

### 式(VII)起始物之合成法

#### 實例(VII-1)

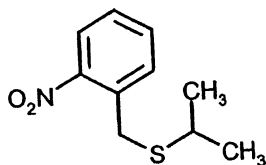


10

在加裝攪拌器、滴加漏斗與溫度計之 1 升三頸燒瓶中，於 30 至 40°C 下，滴加含 63 克 1-(1-氯乙基)-2-硝基苯(VII-1) (純度 99.4%，0.337 莫耳)之 20 毫升 乙腈至含 34.8 克(0.354 莫耳) 2-丙烷硫醇鈉之 450 毫升乙腈中。續於 40°C 下攪拌懸浮液 16 小時後，冷卻，真空排除溶劑。殘質溶於二氯甲烷中，洗滌，經硫酸鈉脫水，真空排除溶劑。粗產物經管柱層析法純化(矽膠，29:1 己烷/丙酮)。得到 48 克(以 HPLC 測得純度 98.8%，產率理論值之 62.4%) 1-[1-(異丙硫基)乙基]-2-硝基苯之黃色油狀物 [ $\log P$  (pH 2.3) = 3.89]。

15

20

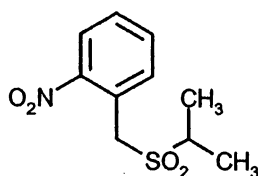
實例(VII-2)

5

在加裝攪拌器、滴加漏斗與溫度計之 250 毫升三頸燒  
 瓶中，滴加含 17.2 克(0.1 莫耳) 2-硝基苯甲基氯之 20 毫升  
 乙腈至冷卻保持 30-40°C 下之含 10.3 克(0.105 莫耳) 2-丙烷  
 硫醇鈉之 75 毫升乙腈中。續於 40-50°C 下攪拌懸浮液 16 小  
 時。為了完成反應，再加 6 克 2-丙烷硫醇鈉(0.061 莫耳)，  
 續於 40-50°C 下攪拌 24 小時。冷卻反應，真空排除溶劑。  
 殘質溶於甲基第三丁基醚中，洗滌，經硫酸鈉脫水。過濾  
 排除硫酸鈉，溶液真空濃縮。粗產物經管柱層析純化(矽  
 膠，50：1 環己烷/乙酸乙酯)。得到 11.8 克(以 HPLC 測得  
 純度 92%，產率理論值之 51.2%) 1-[1-(異丙硫基)甲基]-2-硝  
 基苯之褐色油狀物[logP (pH 2.3) = 3.28]。

10

15

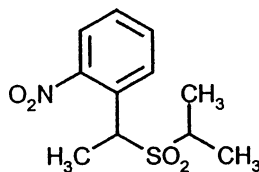
實例(VII-3)

20

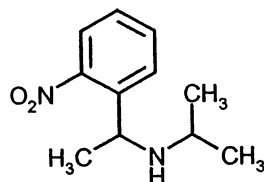
取含 32.8 克 1-[1-(異丙硫基)甲基]-2-硝基苯(VII-2)  
 (0.155 莫耳)之 465 毫升二氯甲烷置入加裝攪拌器、滴加漏

斗與溫度計之 1 升三頸燒瓶中，依序攪拌添加 14.3 克甲酸 (0.31 莫耳) 與 1.6 克鉬酸銨。於室溫下，快速攪拌滴加含 45.3 克 (0.466 莫耳) 35% 過氧化氫溶液。再攪拌混合物 16 小時。排除有機相，以稀釋之亞硫酸氫鈉溶液洗滌一次，以水洗滌一次，然後取有機溶液經硫酸鈉脫水。真空蒸餾排除溶劑，殘質與乙醚攪拌，濾出沉澱產物及乾燥。得到 30.5 克 1-[(異丙基磺醯基)甲基]-2-硝基苯 (以 HPLC 測得純度 99%，產率理論值之 80%) 之黃色固體 [ $\log P$  (pH 2.3) = 1.63]。

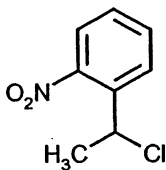
#### 實例(VII-4)



取含 18.9 克 1-[1-(異丙基磺醯基)甲基]-2-硝基苯 (VII-3) (77.7 毫莫耳) 之 390 毫升乙腈置入加裝攪拌器、滴加漏斗與溫度計之 1 升三頸燒瓶中，依序添加 90.1 克 (652 毫莫耳) 碳酸鉀、0.26 克 18-冠-6 與 12.1 克 (85.5 毫莫耳) 碘甲烷。於回流下攪拌反應 4 小時，再加 2.5 克碘甲烷 (17.6 毫莫耳)，續於回流下攪拌 4 小時。反應冷卻與真空濃縮。殘質溶於乙酸乙酯中，以水洗滌，經硫酸鈉脫水。排除溶劑後，粗產物經管柱層析純化 (矽膠，7:3 己烷/丙酮)。產生 16.2 克 1-[1-(異丙基磺醯基)乙基]硝基苯 (以 HPLC 測得純度 96.1%，產率理論值之 77.9%) [ $\log P$  (pH 2) = 1.99]。

實例(VII-5)

取 13.8 克 1-(1-氯乙基)-2-硝基苯(VIII-1) (純度 98.3% , 73.1 毫莫耳)與 43.2 克異丙基胺(731 毫莫耳)於 60°C 及高壓釜之內壓下攪拌 24 小時。反應混合物冷卻後，真空排除過量異丙基胺，粗產物經矽膠使用 4 : 1 環己烷/乙酸乙酯純化。產生 5 克 N-[1-(2-硝基苯基)乙基]丙烷-2-胺(純度 94.4% , 產率理論值之 31%)之油狀物[logP (pH2.3) = 0.55]。

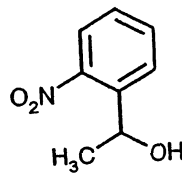
式(VII)起始物之合成法實例(VIII-1)

取 311 克 1-(2-硝基苯基)乙醇(XI-1) (純度 95.8% , 1.78 莫耳)溶於加裝攪拌器、滴加漏斗與溫度計之 6 升三頸燒瓶中之 3000 毫升二甲基甲醯胺中。一次添加全量 921.4 克 (7.13 莫耳)二異丙基乙基胺，攪拌 5 分鐘後，於 20 至 35°C 之間，在良好冷卻下再滴加 612.5 克(5.35 莫耳)甲磺醯氯。

反應停止後，續於室溫下攪拌 90 小時，真空排除溶劑。殘質溶於乙酸乙酯中，以水洗滌 3 次，經硫酸鈉脫水與真空排除溶劑。粗產物經管柱層析純化(矽膠，9:1 己烷/丙酮)。得到 219 克 1-(1-氯乙基)-2-硝基苯(以 HPLC 測得純度 100%，產率理論值之 66.2%)之褐色油狀物[logP (pH 2.3) = 2.87]。

### 式(XI)起始物之合成法

#### 實例(XI-1)



取含 320 克(1.938 莫耳) 2-硝基乙醯苯之 3200 毫升甲醇置入加裝攪拌器、滴加漏斗、溫度計與氣泡計數器之 6 升三頸燒瓶中，然後於 30-40°C 之溫和冷卻下，滴加含 73.3 克 (1.938 莫耳)氫硼化鈉之 288 毫升水溶液。反應停止後，續於室溫下攪拌 16 小時。操作反應時，以稀鹽酸中和，於旋轉蒸發器上排除溶劑。殘質溶於二氯甲烷中，以水洗滌，經硫酸鈉脫水後，真空排除溶劑。產生 311 克 1-(2-硝基苯基) 乙醇(以 HPLC 測得純度 95.1%，產率理論值之 91.3%) [logP (pH 2.3) = 1.49]之淺色油狀物。

上文所示之 logP 之測定法係依據 EEC-指令 79/831

Annex V.A8，採用 HPLC，於逆相管柱(C 18)上進行。溫度：43°C。

測定法之溶離液係於 pH 2.3 之酸性範圍內：0.1%磷酸水溶液，乙腈；10% 乙腈至 90% 乙腈線性梯度。

5 採用已知其 logP 值之未分支之烷-2-酮(3 至 16 個碳原子)進行校正(logP 值之測定法係採用兩種連續烷酮類滯留時間之間線性內插測得)。

$\lambda$ -最大值係使用 200 nm 至 400 nm 之間之 UV 光譜之層析訊號中所測得之最大值。

應用實例：

實例 A

**單囊殼(Podosphaera)試驗(蘋果) / 保護性**

5        溶劑：    24.5 份重量比丙酮  
             24.5 份重量比二甲基乙醯胺  
         乳化劑：1 份重量比烷芳基聚二醇醚

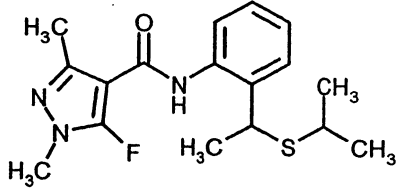
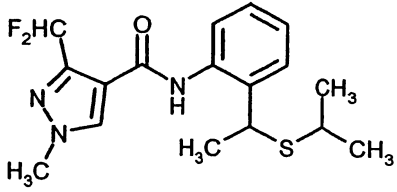
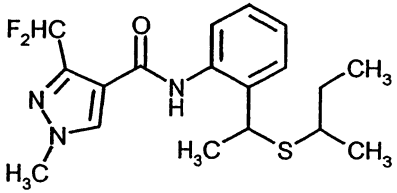
●        製備活性物質之合適製劑時，由 1 份重量比活性物質  
10       與上述量溶劑及乳化劑混合，加水稀釋該濃縮物至所需濃度。

●       測試保護效力時，取活性成分之製劑，依指定施用率  
15       噴灑植物幼苗。噴灑層乾燥後，在植物上接種蘋果黴病病原菌白叉絲單囊殼(*Podosphaera leucotricha*)之水性孢子懸浮液。然後將植物置入約 23℃，相對濕度約 70%之溫室中。

●       接種 10 天後，進行評估，0%表示其效力相當於對照組，而 100%效力表示沒有發現感染。

表 A

單囊殼(Podosphaera)試驗(蘋果) / 保護性

| 根據本發明活性物質                                                                           | 活性物質施用率<br>(g/ha) | 效力% |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------|-----|
|    | 100               | 91  |
|    | 100               | 84  |
|  | 100               | 94  |

實例 B

黑星菌(*Venturia*)試驗(蘋果) / 保護性

溶劑： 24.5 份重量比丙酮

24.5 份重量比二甲基乙醯胺

乳化劑：1 份重量比烷芳基聚二醇醚

製備活性物質之合適製劑時，由 1 份重量比活性物質與上述量溶劑及乳化劑混合，加水稀釋該濃縮物至所需濃度。

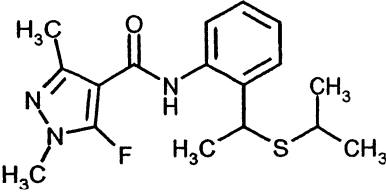
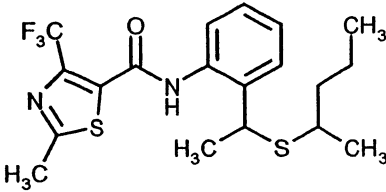
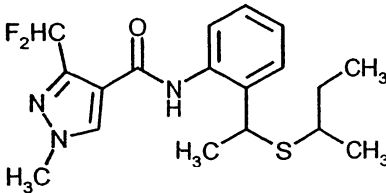
測試保護效力時，取活性成分之製劑，依指定施用率噴灑植物幼苗。噴灑層乾燥後，在植物上接種蘋果瘡痂病原菌蘋果黑星菌(*Venturia inaequalis*)之水性分生孢子懸浮液，然後留在約 20°C 與相對濕度 100% 培養箱中 1 天。

然後將植物置入約 21°C，相對濕度約 90% 之溫室中。

接種 10 天後，進行評估，0% 表示其效力相當於對照組，而 100% 效力表示沒有發現感染。

表 B

黑星菌(Venturia)試驗(蘋果) / 保護性

| 根據本發明活性物質                                                                           | 活性物質施用率<br>(g/ha) | 效力% |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------|-----|
|    | 100               | 95  |
|    | 100               | 89  |
|  | 100               | 99  |

實例 C

灰葡萄孢(*Botrytis*)試驗(豆類) / 保護性

溶劑： 24.5 份重量比丙酮

24.5 份重量比二甲基乙醯胺

乳化劑：1 份重量比烷芳基聚二醇醚

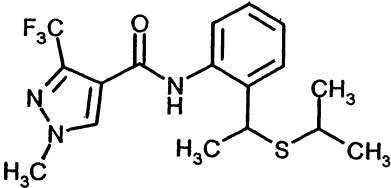
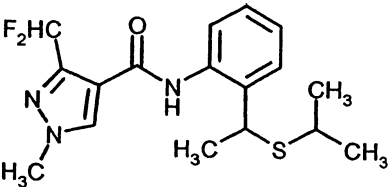
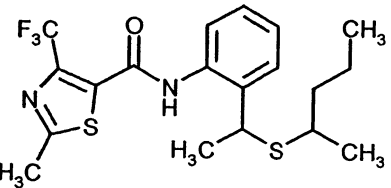
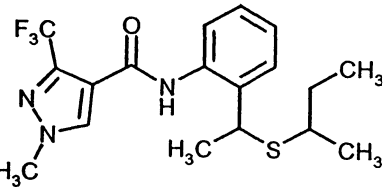
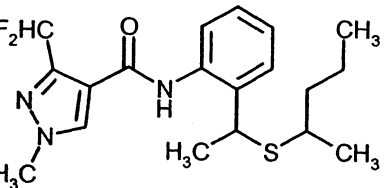
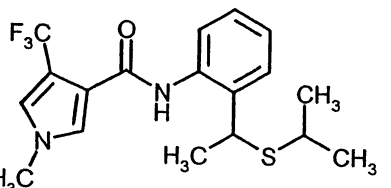
製備活性物質之合適製劑時，由 1 份重量比活性物質與上述量溶劑及乳化劑混合，加水稀釋該濃縮物至所需濃度。

測試保護效力時，取活性成分之製劑，依指定施用率噴灑植物幼苗。噴灑層乾燥後，在各植物葉片上放置 2 小片含有灰葡萄孢(*Botrytis cinerea*)菌落之洋菜。接種後之植物置於約 20°C 與 100%相對濕度之黑暗箱中培養。

接種 2 天後，評估葉面上感染面積大小。0%表示其效力相當於對照組，而 100%效力表示沒有發現感染。

表 C

## 灰葡萄孢(Botrytis)試驗(豆類) / 保護性

| 根據本發明活性物質                                                                                      | 活性物質施用率<br>(g/ha) | 效力% |
|------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------|-----|
| <div>5</div>  | 500               | 84  |
|               | 500               | 100 |
|             | 500               | 99  |
|             | 500               | 100 |
|             | 500               | 97  |
|             | 500               | 97  |

實例 D

柄銹菌(*Puccinia*)試驗(小麥) / 保護性

溶劑： 50 份重量比 N,N-二甲基乙醯胺

5 乳化劑： 1 份重量比烷芳基聚二醇醚

製備活性物質之合適製劑時，由 1 份重量比活性物質與上述量溶劑及乳化劑混合，加水稀釋該濃縮物至所需濃度。

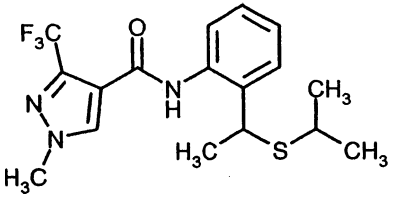
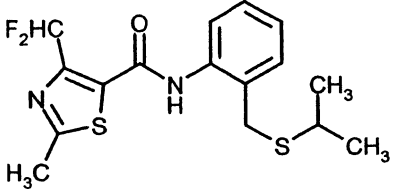
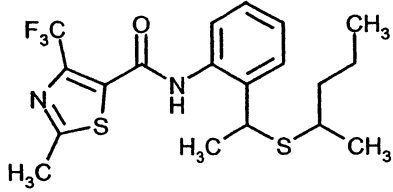
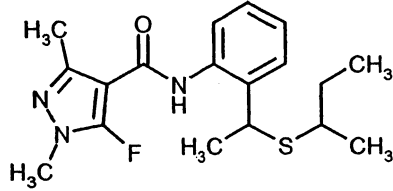
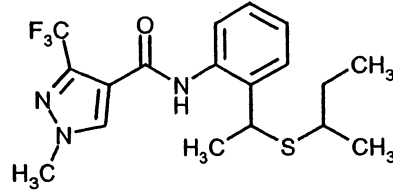
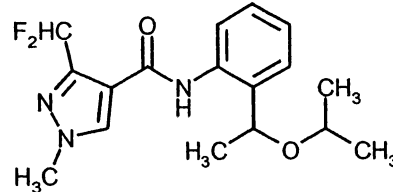
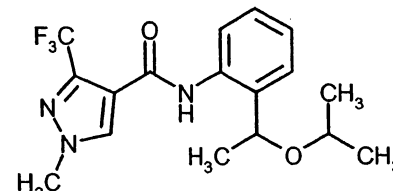
10 測試保護效力時，取活性成分之製劑，依指定施用率噴灑植物幼苗。噴灑層乾燥後，在植物幼苗上噴灑隱匿柄銹菌(*Puccinia recondita*)之分生孢子懸浮液。植物留在 20°C 與 100%相對濕度培養箱中 48 小時。

15 然後將植物置入約 20°C，相對濕度 80%之溫室中，促進銹菌孢狀突起產生。

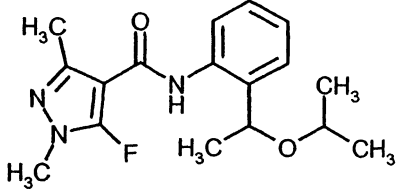
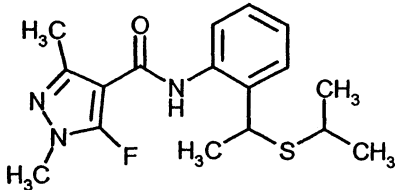
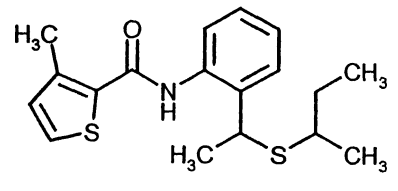
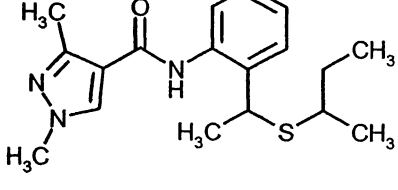
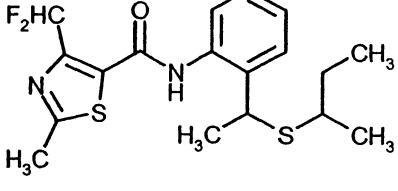
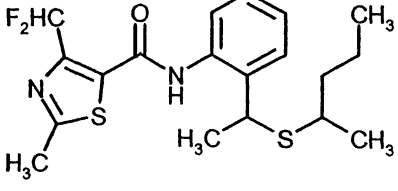
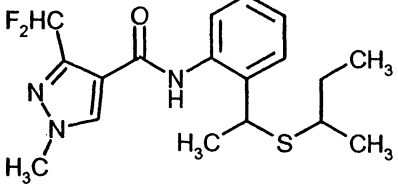
接種 10 天後，進行評估，0%表示其效力相當於對照組，而 100%效力表示沒有發現感染。

表 D

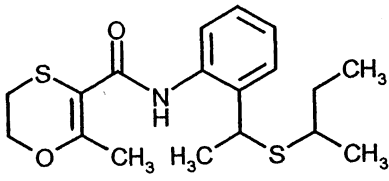
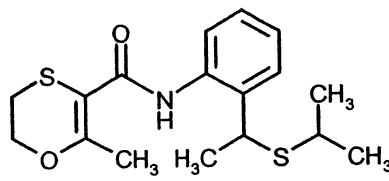
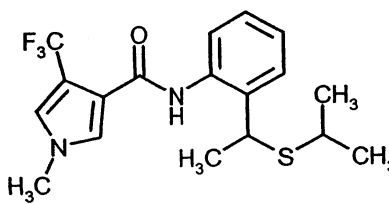
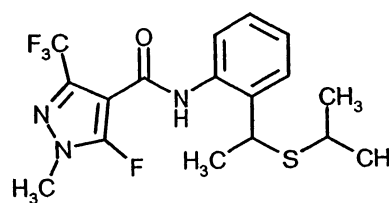
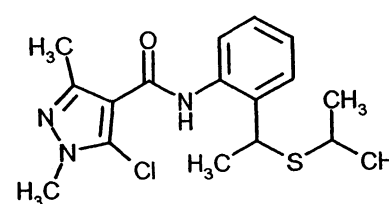
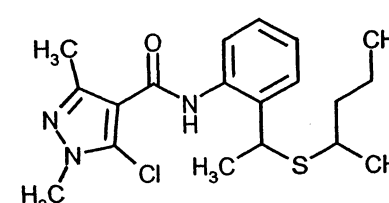
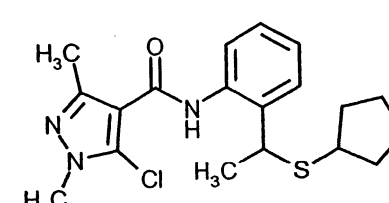
## 柄锈菌(Puccinia)試驗(小麥)/保護性

| 根據本發明活性物質                                                                           | 活性物質施用率<br>(g/ha) | 效力% |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------|-----|
|    | 500               | 100 |
|    | 500               | 93  |
|  | 500               | 100 |
|  | 500               | 100 |
|  | 500               | 100 |
|  | 500               | 100 |
|  | 500               | 100 |

## 柄锈菌(Puccinia)試驗(小麥)/保護性

| 根據本發明活性物質                                                                           | 活性物質施用率<br>(g/ha) | 效力% |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------|-----|
|    | 500               | 100 |
|    | 500               | 100 |
|  | 500               | 100 |
|  | 500               | 100 |
|  | 500               | 100 |
|  | 500               | 100 |
|  | 500               | 100 |

## 柄锈菌(Puccinia)試驗(小麥)/保護性

| 根據本發明活性物質                                                                           | 活性物質施用率<br>(g/ha) | 效力% |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-------------------|-----|
|    | 500               | 100 |
|    | 500               | 100 |
|   | 500               | 100 |
|  | 500               | 96  |
|  | 500               | 100 |
|  | 500               | 100 |
|  | 500               | 100 |

實例 E

鏈格孢(*Alternaria*)試驗(番茄) / 保護性

溶劑： 49 份重量比 N,N-二甲基甲醯胺

5 乳化劑：1 份重量比烷芳基聚二醇醚

製備活性物質之合適製劑時，由 1 份重量比活性物質與上述量溶劑及乳化劑混合，加水稀釋該濃縮物至所需濃度。

10 測試保護效力時，取活性成分之製劑，依指定施用率噴灑植物幼苗。處理一天後，在植物幼苗上噴灑茄生鏈格孢(*Alternaria solani*)之孢子懸浮液。植物留在 20°C 與 100% 相對濕度培養箱中 24 小時。然後將植物置入約 20°C，相對濕度 96% 中。

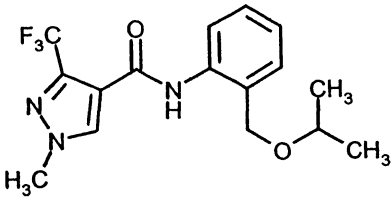
15 接種 7 天後，進行評估，0% 表示其效力相當於對照組，而 100% 效力表示沒有發現感染。

表 E

鏈格孢(Alternaria)試驗(番茄) / 保護性

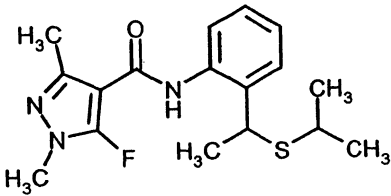
| 根據本發明活性物質 | 活性物質施用率<br>(g/ha) | 效力% |
|-----------|-------------------|-----|
|-----------|-------------------|-----|

5



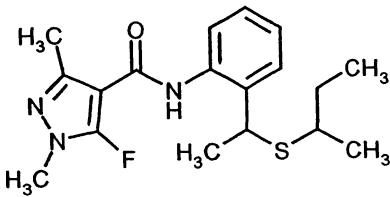
750

95



750

90

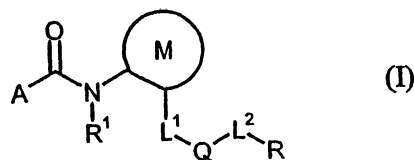


750

95

## 五、中文發明摘要：

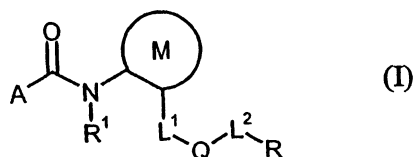
本發明係有關一種新穎之式(I)羧醯胺類



其中  $R^1$ 、 $M$ 、 $L^1$ 、 $Q$ 、 $L^2$ 、 $R$  與  $A$  如本說明書中定義，  
及合成此等化合物之多種方法及其於對抗不要之微生物上  
之用途，及新穎之中間物與其合成法。

## 六、英文發明摘要：

New carboxamides of the formula (I)



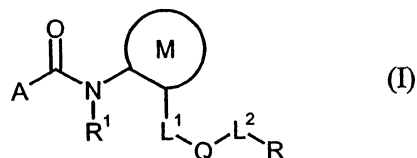
in which

$R^1$ ,  $M$ ,  $L^1$ ,  $Q$ ,  $L^2$ ,  $R$  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)羧醯胺



其中

$R^1$  代表氫、 $C_1$ - $C_8$  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； $C_1$ - $C_6$  鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷硫基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷基-亞磺醯基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷基磺醯基、鹵- $C_1$ - $C_4$ -烷氧基- $C_1$ - $C_4$ -烷基、 $C_3$ - $C_8$  鹵環烷基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子；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；鹵-( $C_1$ - $C_3$ -烷基)羰基- $C_1$ - $C_3$ -烷基、鹵-( $C_1$ - $C_3$ -烷氧基)羰基- $C_1$ - $C_3$ -烷基，其分別含有 1 至 13 個氟、氯與/或溴原子；

( $C_1$ - $C_8$ -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；( $C_1$ - $C_6$ -鹵烷基)羰基、( $C_1$ - $C_6$ -鹵烷氧基)羰基、(鹵- $C_1$ - $C_4$ -烷氧基- $C_1$ - $C_4$ -烷基)羰基、( $C_3$ - $C_8$ -鹵環烷基)羰基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子；或- $C(=O)C(=O)R^2$ 、- $CONR^3R^4$  或- $CH_2NR^5R^6$ ，

$R^2$  代表氫、 $C_1$ - $C_8$  烷基、 $C_1$ - $C_8$  烷氧基、 $C_1$ - $C_4$ -烷氧基

-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>環烷基；C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>鹵烷氧基、鹵-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>鹵環烷基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子，  
 R<sup>3</sup> 與 R<sup>4</sup> 分別獨立代表氫、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基  
 -C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>環烷基；C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷基、鹵-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-  
 烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>鹵環烷基，其分別含有  
 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子，

R<sup>3</sup> 與 R<sup>4</sup> 亦可與其所附接之氮原子共同形成經取代之飽和雜環，其具有 5 至 8 個環原子，且經相同或相異之鹵素或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基取代一次或多次，其中該雜環可另包含 1 或 2 個由氧、硫或 NR<sup>7</sup> 構成之不相鄰雜原子，

R<sup>5</sup> 與 R<sup>6</sup> 分別獨立代表氫、C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>環烷基；C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>鹵烷基、C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>鹵環烷基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子，

R<sup>5</sup> 與 R<sup>6</sup> 亦可與其所附接之氮原子共同形成經取代之飽和雜環，其具有 5 至 8 個環原子，且經相同或相異之鹵素或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>烷基取代一次或多次，其中該雜環可另包含 1 或 2 個由氧、硫或 NR<sup>7</sup> 構成之不相鄰雜原子，

R<sup>7</sup> 代表氫或 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>烷基，

M 分別代表苯基、吡啶或嘧啶、經 R<sup>8</sup> 單一取代之嗒吡或吡吡環或經 R<sup>8-A</sup> 取代之噻唑環，

R<sup>8</sup> 代表氫、氟、氯、甲基、異丙基、甲硫基或三氟

甲基，

$R^8$  亦代表甲氧基，

$R^{8-A}$  代表氫、甲基、甲硫基或三氟甲基，

$L^1$  代表  $C_1-C_{10}$  伸烷基(烷二基)，

$Q$  代表 O、S、SO、SO<sub>2</sub> 或 NR<sup>9</sup>，

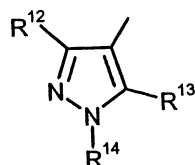
$L^2$  代表一直接鏈結、SiR<sup>10</sup>R<sup>11</sup> 或 CO，

$R$  代表氫、 $C_1-C_8$  烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基、 $C_1-C_4$ -烷氧基  
 $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷硫基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_2-C_8$  烯  
 基、 $C_2-C_8$  炔基、 $C_1-C_6$  鹵烷基、 $C_2-C_6$  鹵烯基、 $C_2-C_6$   
 鹵炔基或  $C_3-C_6$  環烷基，

$R^9$  代表氫、 $C_1-C_8$  烷基、 $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基、  
 $C_1-C_4$ -烷硫基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_2-C_8$  烯基、 $C_2-C_8$  炔  
 基、 $C_1-C_6$  鹵烷基、 $C_2-C_6$  鹵烯基、 $C_2-C_6$  鹵炔基或  
 $C_3-C_6$  環烷基，

$R^{10}$  與  $R^{11}$  分別獨立代表氫、 $C_1-C_8$  烷基、 $C_1-C_8$  烷氧基、  
 $C_1-C_4$ -烷氧基- $C_1-C_4$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷硫基- $C_1-C_4$ -烷  
 基或  $C_1-C_6$ -鹵烷基，

A 代表式(A1)基團



(A1)，其中

$R^{12}$  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、 $C_1-C_4$   
 鹵烷基、 $C_1-C_4$  鹵烷氧基或  $C_1-C_4$  鹵烷硫基(其

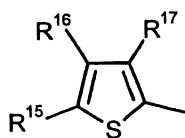
分別含有 1 至 5 個鹵原子)、胺基羰基或胺基羰基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基，

R<sup>13</sup> 代表氫、鹵素、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷氧基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷硫基，

R<sup>14</sup> 代表氫、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、羥基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基、C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 烯基、C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 環烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷硫基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷硫基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-鹵烷氧基-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基(其分別含有 1 至 5 個鹵原子)、或苯基，

或

A 代表式(A2)基團



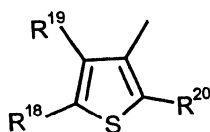
(A2)，其中

R<sup>15</sup> 與 R<sup>16</sup> 分別獨立代表氫、鹵素、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基，

R<sup>17</sup> 代表鹵素、氰基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5 個鹵原子)，

或

A 代表式(A3)基團



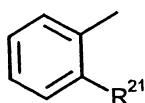
(A3)，其中

$R^{18}$  與  $R^{19}$  分別獨立代表氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

$R^{20}$  代表氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

或

A 代表式(A4)基團

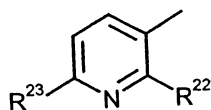


(A4)，其中

$R^{21}$  代表氫、鹵素、羥基、氰基、 $C_1$ - $C_6$ -烷基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷氧基或  $C_1$ - $C_4$  鹵烷硫基(其分別含有 1 至 5 個鹵原子)，

或

A 代表式(A5)基團



(A5)，其中

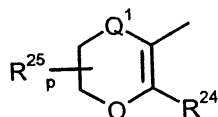
$R^{22}$  代表鹵素、羥基、氰基、 $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_1$ - $C_4$  烷氧基、 $C_1$ - $C_4$  烷硫基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷硫基或  $C_1$ - $C_4$  鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5 個鹵原子)，

$R^{23}$  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、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$ -鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5 個鹵原子)、 $C_1$ - $C_4$

烷基亞磺醯基或 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基磺醯基，

或

A 代表式(A6)基團



(A6)，其中

R<sup>24</sup> 代表 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基，

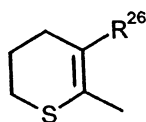
R<sup>25</sup> 代表 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基，

Q<sup>1</sup> 代表 S(硫)、SO、SO<sub>2</sub> 或 CH<sub>2</sub>，

p 代表 0、1 或 2，若 p 為 2 時，則 R<sup>25</sup> 代表相同或相異之基團，

或

A 代表式(A7)基團

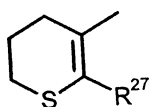


(A7)，其中

R<sup>26</sup> 代表 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 鹵烷基，

或

A 代表式(A8)基團

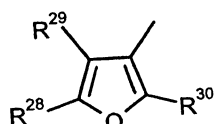


(A8)，其中

$R^{27}$  代表  $C_1-C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1-C_4$  鹵烷基，

或

A 代表式(A9)基團

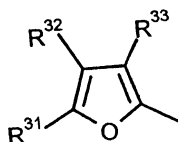


(A9)，其中

$R^{28}$  與  $R^{29}$  分別獨立代表氫、鹵素、胺基、 $C_1-C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1-C_4$  鹵烷基，  
 $R^{30}$  代表氫、鹵素、 $C_1-C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1-C_4$  鹵烷基，

或

A 代表式(A10)基團

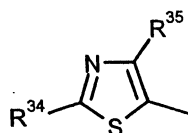


(A10)，其中

$R^{31}$  與  $R^{32}$  分別獨立代表氫、鹵素、胺基、硝基、 $C_1-C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1-C_4$  鹵烷基，  
 $R^{33}$  代表氫、鹵素、 $C_1-C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1-C_4$  鹵烷基，

或

A 代表式(A11)基團



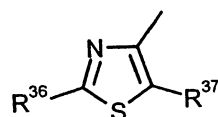
(A11)，其中

$R^{34}$  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、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

$R^{35}$  代表鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

或

A 代表式(A12)基團



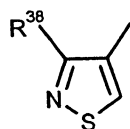
(A12)，其中

$R^{36}$  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、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

$R^{37}$  代表鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

或

A 代表式(A13)基團

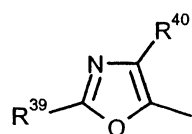


(A13)，其中

$R^{38}$  代表鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基，

或

A 代表式(A14)基團



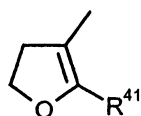
(A14), 其中

$R^{39}$  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)基團

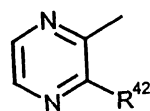


(A15), 其中

$R^{41}$  代表  $C_1-C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1-C_4$  鹵烷基，

或

A 代表式(A16)基團

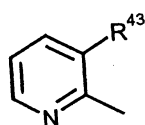


(A16), 其中

$R^{42}$  代表氫、鹵素、 $C_1-C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1-C_4$  鹵烷基，

或

A 代表式(A17)基團

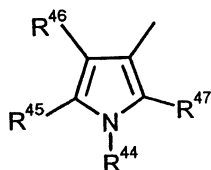


(A 17), 其中

$R^{43}$  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、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷硫基或  $C_1$ - $C_4$  鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5 個鹵原子),

或

A 代表式(A18)基團



(A18), 其中

$R^{44}$  代表氫、氰基、 $C_1$ - $C_4$  烷基、含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$ -烷氧基- $C_1$ - $C_4$  烷基、羥基- $C_1$ - $C_4$  烷基、 $C_1$ - $C_4$  烷基磺醯基、二( $C_1$ - $C_4$  烷基)胺基磺醯基、 $C_1$ - $C_6$  烷基羰基或分別可經取代之苯基磺醯基或苯甲醯基,

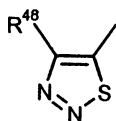
$R^{45}$  代表氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基,

$R^{46}$  代表氫、鹵素、氰基、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基,

$R^{47}$  代表氫、鹵素、 $C_1$ - $C_4$  烷基或含有 1 至 5 個鹵原子之  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基,

或

A 代表式(A19)基團



(A19), 其中

$R^{48}$  代表  $C_1-C_4$  烷基。

2. 根據申請專利範圍第 1 項之式(I)羧醯胺，其中若  $L^2$  為一直接鏈結時，則  $R$  不為烷氧基。

3. 根據申請專利範圍第 1 或 2 項之式(I)羧醯胺，其中

$R^1$  代表氫、 $C_1-C_6$ -烷基、 $C_1-C_4$ -烷基亞磺醯基、 $C_1-C_4$ -  
 烷磺醯基、 $C_1-C_3$ -烷氧基- $C_1-C_3$ -烷基、 $C_3-C_6$ -環烷  
 基； $C_1-C_4$ -鹵烷基、 $C_1-C_4$ -鹵烷硫基、 $C_1-C_4$ -鹵烷  
 基亞磺醯基、 $C_1-C_4$ -鹵烷基磺醯基、鹵- $C_1-C_3$ -烷氧  
 基- $C_1-C_3$ -烷基、 $C_3-C_8$ -鹵環烷基，其分別具有 1 至  
 9 個氟、氯與/或溴原子；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；鹵-( $C_1-C_3$ -烷基)羰基- $C_1-C_3$ -  
 烷基、鹵-( $C_1-C_3$ -烷氧基)羰基- $C_1-C_3$ -烷基，其分別  
 具有 1 至 13 個氟、氯與/或溴原子；( $C_1-C_6$ -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；( $C_1-C_4$ -鹵烷基)  
 羰基、( $C_1-C_4$ -鹵烷氧基)羰基、(鹵- $C_1-C_3$ -烷氧基  
 - $C_1-C_3$ -烷基)羰基、( $C_3-C_6$ -鹵環烷基)羰基，其分別  
 具有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子；或  $-C(=O)$   
 $C(=O)R^2$ 、 $-CONR^3R^4$  或  $-CH_2NR^5R^6$ ，

$R^2$  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； $C_1-C_4$ -鹵烷基、  
 $C_1-C_4$ -鹵烷氧基、鹵- $C_1-C_3$ -烷氧基- $C_1-C_3$ -烷基、  
 $C_3-C_6$ -鹵環烷基，其分別具有 1 至 9 個氟、氯與/

或溴原子；

$R^3$  與  $R^4$  分別獨立代表氫、 $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_1$ - $C_3$  烷氧基、 $C_1$ - $C_3$  烷基、 $C_3$ - $C_6$  環烷基； $C_1$ - $C_4$  鹵烷基、鹵- $C_1$ - $C_3$ -烷氧基- $C_1$ - $C_3$ -烷基、 $C_3$ - $C_6$  鹵環烷基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子，

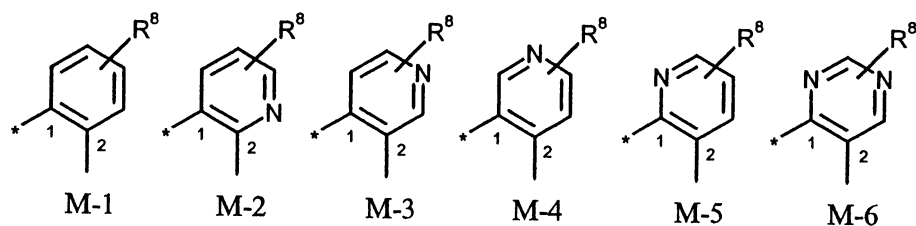
$R^3$  與  $R^4$  亦可與其所附接之氮原子共同形成經取代之飽和雜環，其具有 5 至 8 個環原子，且經相同或相異之鹵素或  $C_1$ - $C_4$  烷基取代一次或多次，其中該雜環可另包含 1 或 2 個由氧、硫或  $NR^7$  構成之不相鄰雜原子，

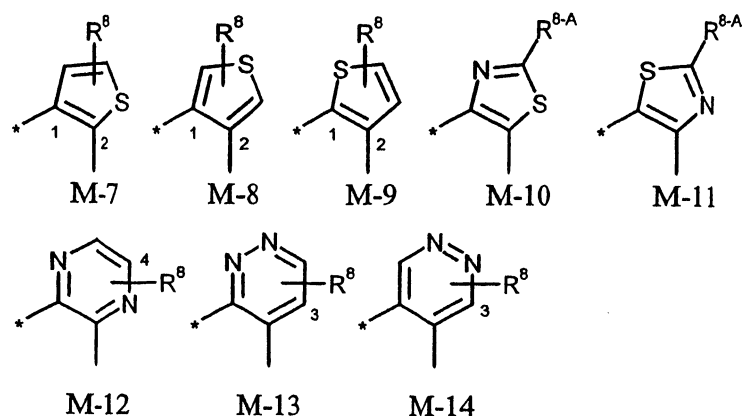
$R^5$  與  $R^6$  分別獨立代表氫、 $C_1$ - $C_6$ -烷基、 $C_3$ - $C_6$  環烷基； $C_1$ - $C_4$  鹵烷基、 $C_3$ - $C_6$  鹵環烷基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子，

$R^5$  與  $R^6$  亦可與其所附接之氮原子共同形成經取代之飽和雜環，其具有 5 至 8 個環原子，且經相同或相異之鹵素或  $C_1$ - $C_4$  烷基取代一次或多次，其中該雜環可另包含 1 或 2 個由氧、硫或  $NR^7$  構成之不相鄰雜原子，

$R^7$  代表氫或  $C_1$ - $C_4$  烷基，

M 代表下列環之一：





其中以星號表示之鍵結係與醯胺鍵結。

$R^8$  代表氫、氟、氯、甲基、異丙基、甲硫基或三氟甲基，

$R^8$  亦代表甲氧基，

$R^{8-A}$  代表氫、甲基、甲硫基或三氟甲基，

$L^1$  代表  $C_1$ - $C_{10}$  伸烷基(烷二基)，

$Q$  代表 O、S、SO、 $SO_2$  或  $NR^9$ ，

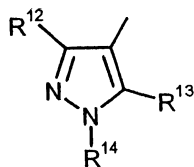
$L^2$  代表一直接鍵結、 $SiR^{10}R^{11}$  或 CO，

$R$  代表氫、 $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ -烷氧基- $C_1$ - $C_3$ -烷基、 $C_1$ - $C_3$ -烷硫基- $C_1$ - $C_3$ -烷基或  $C_1$ - $C_4$  鹵烷基或  $C_3$ - $C_6$  環烷基，

$R^9$  代表氫、 $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_1$ - $C_3$ -烷氧基- $C_1$ - $C_3$ -烷基、 $C_1$ - $C_3$ -烷硫基- $C_1$ - $C_3$ -烷基或  $C_3$ - $C_6$  環烷基，

$R^{10}$  與  $R^{11}$  較佳為分別獨立代表  $C_1$ - $C_6$  烷基、 $C_1$ - $C_6$  烷氧基、 $C_1$ - $C_3$ -烷氧基- $C_1$ - $C_3$ -烷基或  $C_1$ - $C_3$ -烷硫基- $C_1$ - $C_3$ -烷基，

A 代表式(Al)基團



(A1), 其中

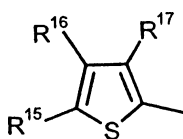
$R^{12}$  代表氫、氟基、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基、異丙基、甲氧基、乙氧基、甲硫基、乙硫基、環丙基、 $C_1$ - $C_2$ -鹵烷基、 $C_1$ - $C_2$ -鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子)、三氟甲硫基、二氟甲硫基、胺基羰基、胺基羰基甲基或胺基羰基乙基，

$R^{13}$  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、含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1$ - $C_2$ -鹵烷基、羥基甲基、羥基乙基、環丙基、環戊基、環己基或苯基，

或

A 代表(A2)基團



(A2), 其中

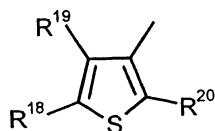
$R^{15}$  與  $R^{16}$  分別獨立代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基或具有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1$ - $C_2$ -鹵烷基，

$R^{17}$  代表氟、氯、溴、氟基、甲基、乙基、 $C_1$ - $C_2$ -鹵烷基或  $C_1$ - $C_2$ -鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5

個氟、氯與/或溴原子)，

或

A 代表式(A3)基團



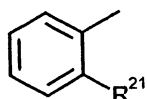
(A3)，其中

R<sup>18</sup> 與 R<sup>19</sup> 分別獨立代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基或含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-鹵烷基，

R<sup>20</sup> 代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基、或含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-鹵烷基，

或

A 代表式(A4)基團

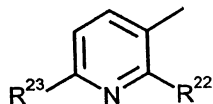


(A4)，其中

R<sup>21</sup> 代表氫、氟、氯、溴、碘、羥基、氰基、C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-烷基、C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-鹵烷基或 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>-鹵烷氧基或 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>鹵烷硫基(其分別含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子)，

或

A 代表式(A5)基團

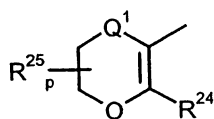


(A5)，其中

$R^{22}$  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、 $C_1$ - $C_2$ -鹵烷基或  $C_1$ - $C_2$ -鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子),  
 $R^{23}$  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、 $C_1$ - $C_2$ -鹵烷基或  $C_1$ - $C_2$ -鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子)、 $C_1$ - $C_2$ -烷亞磺醯基或  $C_1$ - $C_2$ -烷磺醯基,

或

A 代表式(A6)基團



(A6), 其中

$R^{24}$  代表甲基、乙基或含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1$ - $C_2$ -鹵烷基,

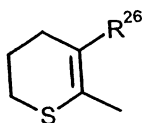
$R^{25}$  代表甲基或乙基,

$Q^1$  代表 S(硫)、 $SO_2$  或  $CH_2$ ,

p 代表 0 或 1,

或

A 代表式(A7)基團



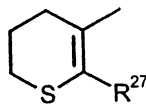
(A7), 其中

$R^{26}$  代表甲基、乙基或含有 1 至 5 個氟、氯與/或

溴原子之  $C_1-C_2$ -鹵烷基，

或

A 代表式(A8)基團

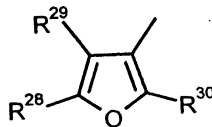


(A8)，其中

$R^{27}$  代表甲基、乙基、三氟甲基、二氟甲基、二氟氯甲基或三氯甲基，

或

A 代表式(A9)基團



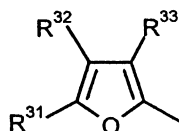
(A9)，其中

$R^{28}$  與  $R^{29}$  分別獨立代表氫、氟、氯、溴、胺基、  
甲基、乙基、或含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴  
原子之  $C_1-C_2$ -鹵烷基，及

$R^{30}$  代表氫、氟、氯、溴、碘、甲基、乙基、或含  
有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1-C_2$ -鹵烷基，

或

A 代表式(A10)基團



(A10)，其中

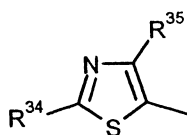
$R^{31}$  與  $R^{32}$  分別獨立代表氫、氟、氯、溴、胺基、  
硝基、甲基、乙基、或含有 1 至 5 個氟、氯

與/或溴原子之  $C_1-C_2$ -鹵烷基及

$R^{33}$  代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基、或含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1-C_2$ -鹵烷基，

或

A 代表式(A11)基團



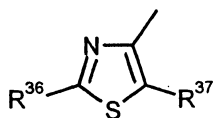
(A11)，其中

$R^{34}$  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、乙基或含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1-C_2$ -鹵烷基及

$R^{35}$  代表氟、氯、溴、甲基、乙基或含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1-C_2$ -鹵烷基，

或

A 代表式(A12)基團



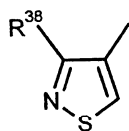
(A12)，其中

$R^{36}$  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、或含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1-C_2$ -鹵烷基，

$R^{37}$  代表氟、氯、溴、甲基、乙基或含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1-C_2$ -鹵烷基，

或

A 代表式(A13)基團



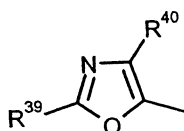
(A13), 其中

5

$R^{38}$  代表氟、氯、溴、甲基、乙基或含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1$ - $C_2$ -鹵烷基,

或

A 代表式(A14)基團



(A14), 其中

10

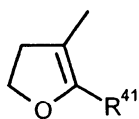
$R^{39}$  代表氫、甲基或乙基,

$R^{40}$  代表氟、氯、溴、甲基或乙基,

15

或

A 代表式(A15)基團



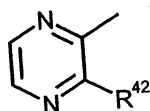
(A15), 其中

20

$R^{41}$  代表甲基、乙基或含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1$ - $C_2$ -鹵烷基,

或

A 代表式(A16)基團

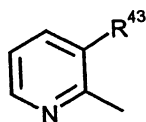


(A16), 其中

$R^{42}$  代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基或含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1$ - $C_2$ -鹵烷基，

或

A 代表式(A17)基團

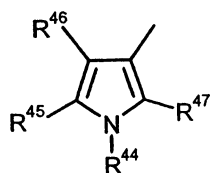


(A17), 其中

$R^{43}$  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、 $C_1$ - $C_2$ -鹵烷基或  $C_1$ - $C_2$  鹵烷氧基(其分別含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子)，

或

A 代表式(A18)基團



(A18), 其中

$R^{44}$  代表氫、甲基、乙基、含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1$ - $C_2$ -鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$ -烷氧基- $C_1$ - $C_4$ -烷基、羥基甲基、羥基乙基、甲磺醯基或二甲基胺基磺醯基，

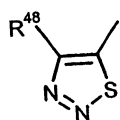
$R^{45}$  代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基或含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1$ - $C_2$ -鹵烷基，

$R^{46}$  代表氫、氟、氯、溴、碘、氰基、甲基、乙基、異丙基或具有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1-C_2$ -鹵烷基，

$R^{47}$  代表氫、氟、氯、溴、甲基、乙基、或含有 1 至 5 個氟、氯與/或溴原子之  $C_1-C_2$ -鹵烷基，

或

A 代表式(A19)

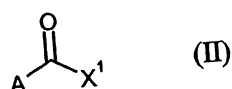


(A 19)，其中

$R^{48}$  代表甲基、乙基、正丙基或異丙基。

4. 一種合成根據申請專利範圍第 1 項之式(I)羧醯胺之方法，其特徵在於

(a) 式(II)羧酸衍生物

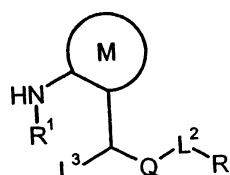


其中

A 如上述定義，及

$X^1$  代表鹵素或羥基，

與式(III)苯胺衍生物反應



(III)

其中

$R^1$ 、 $M$ 、 $Q$ 、 $L^2$  與  $R$  如上述定義，

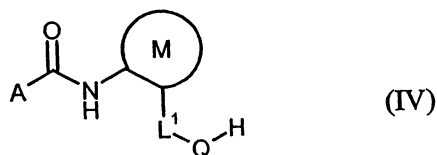
$L^3$  代表氫或  $C_1$ - $C_9$  烷基，

可能於觸媒之存在下，可能於縮合劑之存在下，

可能於酸結合劑之存在下，及可能於稀釋劑之存在下進行，

或

(b) 式(IV)羧醯胺



其中  $M$ 、 $L^1$ 、 $Q$  與  $A$  如上述定義，

與式(V)化合物反應



其中

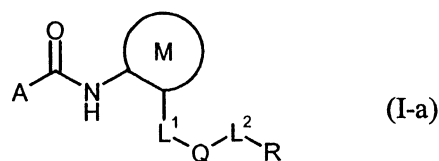
$L^2$  與  $R$  如上述定義，

$Y$  代表鹵素、三氟甲基磺醯基、甲基磺醯基或  
4-甲基苯基磺醯基，

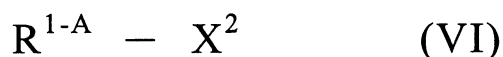
其係於鹼之存在下及於稀釋介質之存在下進行，

或

(c) 式(I-a)羧醯胺



其中  $M$ 、 $L^1$ 、 $Q$ 、 $L^2$ 、 $R$  與  $A$  如上述定義，  
與式(VI)鹵化物反應



其中

$X^2$  代表氯、溴或碘，

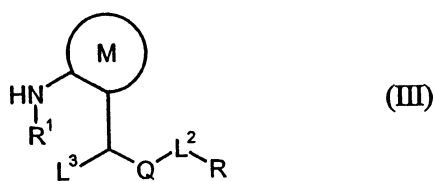
$R^{1-A}$  代表  $C_1$ - $C_8$  烷基、 $C_1$ - $C_6$  烷基亞磺基、 $C_1$ - $C_6$  烷基磺基、 $C_1$ - $C_4$ -烷氧基- $C_1$ - $C_4$ -烷基、 $C_3$ - $C_8$  環烷基； $C_1$ - $C_6$  鹵烷基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷硫基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷基-亞磺基、 $C_1$ - $C_4$  鹵烷基磺基、鹵- $C_1$ - $C_4$ -烷氧基- $C_1$ - $C_4$ -烷基、 $C_3$ - $C_8$  鹵環烷基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子；甲磺基、甲磺基- $C_1$ - $C_3$ -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- $C_1$ - $C_3$ -烷基鹵-( $C_1$ - $C_3$ -烷基)羰基- $C_1$ - $C_3$ -烷基、鹵-( $C_1$ - $C_3$ -烷氧基)羰基- $C_1$ - $C_3$ -烷基，其分別含有 1 至 13 個氟、氯與/或溴原子；( $C_1$ - $C_8$ -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；( $C_1$ - $C_6$ -鹵烷基)羰基、( $C_1$ - $C_6$ -鹵烷氧基)羰基、(鹵- $C_1$ - $C_4$ -烷氧基- $C_1$ - $C_4$ -烷基)羰基、( $C_3$ - $C_8$ -鹵環烷基)羰基，其分別含有 1 至 9 個氟、氯與/或溴原子；或

$-\text{C}(=\text{O})\text{C}(=\text{O})\text{R}^2$ 、 $-\text{CONR}^3\text{R}^4$  或  $-\text{CH}_2\text{NR}^5\text{R}^6$ ，

其中  $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^5$  與  $\text{R}^6$  如上述定義，

其係於鹼之存在下及於稀釋介質之存在下進行。

5. 一種用於控制不要之微生物之介質，其特徵在於其中包含至少一種根據申請專利範圍第 1 項之式(I)羧醯胺及補充劑與/或界面活性劑。
6. 一種以根據申請專利範圍第 1 項之式(I)羧醯胺於控制不要之微生物上之用途。
7. 一種控制不要之微生物之方法，其特徵在於施用根據申請專利範圍第 1 項之式(I)羧醯胺至微生物與/或其環境上。
8. 一種合成用於對抗不要之微生物之材料之方法，其特徵在於混合根據申請專利範圍第 1 項之式(I)羧醯胺與補充劑與/或界面活性劑。
9. 一種式(III)苯胺衍生物



其中

$\text{R}^1$ 、 $\text{M}$ 、 $\text{Q}$ 、 $\text{L}^2$  與  $\text{R}$  如申請專利範圍第 1 項之定義，及  $\text{L}^3$  代表氫或  $\text{C}_1$ - $\text{C}_9$  烷基。

七、指定代表圖：

(一)本案指定代表圖為：第 ( ) 圖。 無

(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